



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201026690 A1

(43)公開日：中華民國 99 (2010) 年 07 月 16 日

(21)申請案號：098129480

(22)申請日：中華民國 98 (2009) 年 09 月 02 日

(51)Int. Cl.：

C07D409/12 (2006.01)

A01N43/54 (2006.01)

A01P3/00 (2006.01)

C07D239/42 (2006.01)

(30)優先權：2008/09/03 歐洲專利局 08163560.9

(71)申請人：拜耳作物科學股份有限公司 (德國) BAYER CROPSCIENCE

AKTIENGESELLSCHAFT (DE)

德國

(72)發明人：格瑞爾 喬格 GREUL, JOERG NICO (DE)；哈姆克 韓德克 HELMKE, HENDRIK (DE)；喜爾布蘭 史代芬 HILLEBRAND, STEFAN (DE)；馬堤斯 阿摩斯 MATTES, AMOS (DE)；尼星 卡爾 NISING, CARL FRIEDRICH (DE)；瓦奈爾 皮爾 WASNAIRE, PIERRE (DE)；瓦程多 尤瑞克 WACHENDORFF-NEUMANN, ULRIKE (DE)；達門 彼得 DAHMEN, PETER (DE)；維爾斯堤 恩德 VOERSTE, ARND (DE)；梅斯納 露絲 MEISSNER, RUTH (DE)；布朗 克里斯多夫 BRAUN, CHRISTOPH ANDREAS (DE)；考斯門 馬汀 KAUSSMANN, MARTIN (DE)；波多野廣幸 HADANO, HIROYUKI (JP)

(74)代理人：林秋琴；何愛文

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：12 項 圖式數：0 共 109 頁

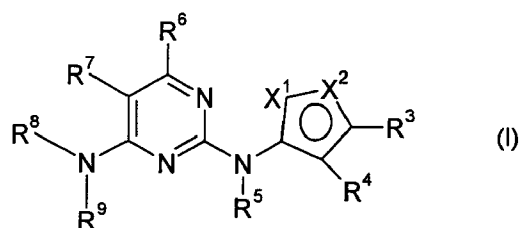
(54)名稱

用作殺真菌劑之噻吩基胺基嘧啶

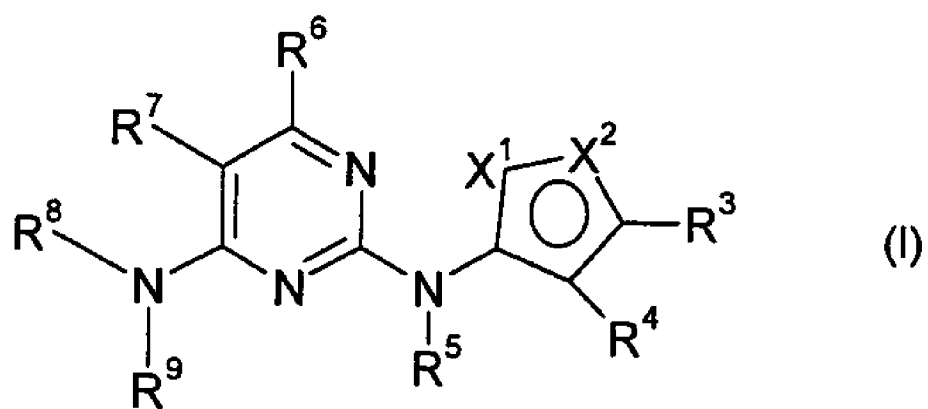
THIENYLAMINOPYRIMIDINES AS FUNGICIDES

(57)摘要

式(I)之噻吩基胺基嘧啶



其中 R^1 至 R^{10} 與 X^1 及 X^2 具有在說明書內所給定義，以及其農業化學上之活性鹽類、其用於控制在植物內及/或植物上，或是在植物的種子內或種子上的植物病原性有害真菌的用途及方法及組成物。也關於製備這樣的組成物及處理的種子之方法且也關於其用於控制在農業、園藝及林業、材料的保護及家居及衛生領域中的植物病原性有害真菌的用途。本發明也關於製備式(I)之噻吩基胺基嘧啶之方法。





(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201026690 A1

(43)公開日：中華民國 99 (2010) 年 07 月 16 日

(21)申請案號：098129480

(22)申請日：中華民國 98 (2009) 年 09 月 02 日

(51)Int. Cl.：

C07D409/12 (2006.01)

A01N43/54 (2006.01)

A01P3/00 (2006.01)

C07D239/42 (2006.01)

(30)優先權：2008/09/03 歐洲專利局 08163560.9

(71)申請人：拜耳作物科學股份有限公司 (德國) BAYER CROPSCIENCE

AKTIENGESELLSCHAFT (DE)

德國

(72)發明人：格瑞爾 喬格 GREUL, JOERG NICO (DE)；哈姆克 韓德克 HELMKE, HENDRIK (DE)；喜爾布蘭 史代芬 HILLEBRAND, STEFAN (DE)；馬堤斯 阿摩斯 MATTES, AMOS (DE)；尼星 卡爾 NISING, CARL FRIEDRICH (DE)；瓦奈爾 皮爾 WASNAIRE, PIERRE (DE)；瓦程多 尤瑞克 WACHENDORFF-NEUMANN, ULRIKE (DE)；達門 彼得 DAHMEN, PETER (DE)；維爾斯堤 恩德 VOERSTE, ARND (DE)；梅斯納 露絲 MEISSNER, RUTH (DE)；布朗 克里斯多夫 BRAUN, CHRISTOPH ANDREAS (DE)；考斯門 馬汀 KAUSSMANN, MARTIN (DE)；波多野廣幸 HADANO, HIROYUKI (JP)

(74)代理人：林秋琴；何愛文

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：12 項 圖式數：0 共 109 頁

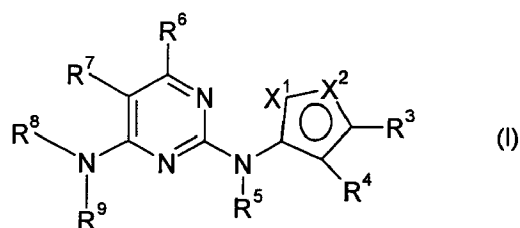
(54)名稱

用作殺真菌劑之噻吩基胺基嘧啶

THIENYLAMINOPYRIMIDINES AS FUNGICIDES

(57)摘要

式(I)之噻吩基胺基嘧啶



其中 R^1 至 R^{10} 與 X^1 及 X^2 具有在說明書內所給定義，以及其農業化學上之活性鹽類、其用於控制在植物內及/或植物上，或是在植物的種子內或種子上的植物病原性有害真菌的用途及方法及組成物。也關於製備這樣的組成物及處理的種子之方法且也關於其用於控制在農業、園藝及林業、材料的保護及家居及衛生領域中的植物病原性有害真菌的用途。本發明也關於製備式(I)之噻吩基胺基嘧啶之方法。

六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明關於噻吩基胺基嘧啶及其農業化學上活性鹽類。關於其用於控制在植物內及/或植物上，或是在植物的種子內或種子上的有害之植物病原性真菌的用途及方法及組成物。關於製備這樣的組成物及處理的種子之方法且也關於用於控制在農業、園藝、林業、材料保護及家居及衛生領域中出現的植物病原性有害之真菌的用途。本發明也關於製備噻吩基胺基嘧啶之方法。

由於環境的及經濟上對於現今的作物保護劑類之要求，例如，活性譜、毒性、選擇性、施用率、殘留物之形成、及有利的製造方面，持續增加中，且，更可能有另外的問題，例如，對於已知的活性化合物發展出抗性，故對於至少在某些方面具有較已知部分為有利之新殺真菌劑，有固定研發新的殺真菌劑之需求。

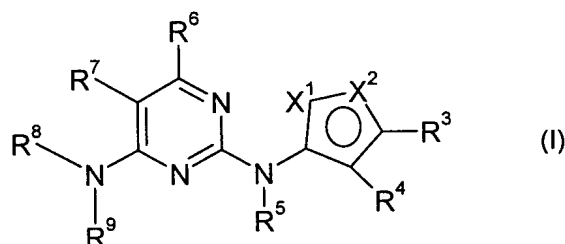
令人驚喜地，已發現，本發明之經噻吩取代的胺基嘧啶類可解決至少一些被提及的主題並適於作為作物保護劑，特別是殺真菌劑使用。

【先前技術】

經磺醯胺取代的胺基嘧啶類為已知的藥學上活性化合物(見，例如，WO 03/076437)，但並不知其具有令人驚訝之殺真菌活性。

【發明內容】

本發明提供式(I)的化合物



其中一或多個符號具有下面的定義之一：

X^1 代表硫或 CR^1 ，

X^2 代表硫或 CR^2 ，

其中恰好地， X^1 及 X^2 基之一代表硫原子，

R^1 代表氫、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基或鹵素，

如果 X^2 代表 CR^2 ，

R^2 及 R^3 彼此獨立地代表氫、鹵素、CN、硝基、 OR^{10} 、

$O(CH_2)_mOR^{10}$ 、 $O[C(R^{10})_2]_mOR^{10}$ 、 $O[C(R^{10})_2]_mN(R^{10})_2$ 、

$OCOR^{11}$ 、 SR^{10} 、 SOR^{10} 、 SO_2R^{10} 、 $C=OR^{10}$ 、 $CH=NOR^{10}$ 、

$CR^{11}=NOR^{10}$ 、 $COCl$ 、 $CON(R^{10})_2$ 、 $COOR^{10}$ 、 $NR^{10}COR^{10}$ 、

$N(R^{10})_2$ 、 $[C(R^{10})_2]_mCN$ 、 $(CH_2)_mOR^{10}$ 、 $(CH_2)_mSR^{10}$ 、

$[C(R^{10})_2]_mSR^{10}$ 、 $(CH_2)_mSOR^{10}$ 、 $(CH_2)_mSO_2R^{10}$ 、 $(CH_2)_mN(R^{10})_2$ 、

$[C(R^{10})_2]_mN(R^{10})_2$ 、 $(CH_2)_mCOR^{10}$ 、 $[C(R^{10})_2]_mOR^{10}$ 、

$[C(R^{10})_2]_mCOR^{10}$ 、無取代的或經取代的 C_1 - C_8 -烷基、 C_2 - C_6 -烯基或 C_1 - C_8 -鹵基烷基；其中 $m = 1-4$ 、

其中取代基彼此獨立地為挑選自包括下述基：

氫、氟、氯或溴、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、羥基、氧代基、 C_1 - C_4 -鹵基烷基及氰基，

其中，如果 X^2 代表硫原子，上述定義僅適用於 R^3 ，

R^4 代表氫、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基或鹵素，

R^5 代表氫、 C_1 - C_2 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -三烷基矽烷基、 C_1 - C_4 -三烷基矽烷基乙基、 C_1 - C_4 -二烷基單苯基矽烷基、 CHO 、(C_1 - C_4 -烷基)羰基、(C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基)羰基、(C_3 - C_6 -烯氧基)羰基、(C_3 - C_6 -環烷基)羰基、(鹵基- C_1 - C_4 -烷氧基-

C₁-C₄-烷基)羰基、(C₁-C₄-鹵基烷基)羰基、(C₁-C₄-烷氧基)羰基、(C₁-C₄-鹵基烷氧基)羰基、苯甲基氧羰基、無取代的或經取代的苯甲基、無取代的或經取代的 C₂-C₆-烯基、無取代的或經取代的 C₂-C₆-炔基、C₁-C₂-烷基亞磺醯基或 C₁-C₂-烷基磺醯基，

其中取代基彼此獨立地為挑選自包括下述基：

氫、鹵素、硝基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、羥基、C₁-C₄-鹵基烷基或氰基，

R⁶ 代表氫、C₁-C₃-烷基、氰基或 C₁-C₃-鹵基烷基，

R⁷ 代表鹵素、氰基、C₁-C₃-烷基、C₁-C₃-鹵基烷基、C₁-C₃-鹵基烷氧基、SMe、SOMe 或 SO₂Me，

R⁸ 代表氫、C₁-C₂-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₆-三烷基矽烷基、C₁-C₄-三烷基矽烷基乙基、C₁-C₄-二烷基單苯基矽烷基、(C₁-C₄-烷基)羰基、(C₁-C₄-鹵基烷基)羰基、(C₁-C₄-烷氧基)羰基、無取代的或經取代的苯甲基、無取代的或經取代的 C₂-C₆-烯基、無取代的或經取代的 C₂-C₆-炔基、C₁-C₆-烷基亞磺醯基、C₁-C₆-烷基磺醯基、C₁-C₆-鹵基烷基亞磺醯基或 C₁-C₆-鹵基烷基磺醯基、

其中取代基彼此獨立地為挑選自包括下述基：

氟、氯及溴原子、氰基、羥基、甲氧基及 CF₃，

R⁹ 代表直-鏈或分枝的無取代的或經取代的 C₁-C₇-烷基、直-鏈或分枝的無取代的或經取代的 C₂-C₇-鹵基烷基、無取代的或經取代的 C₃-C₇-環烷基、直-鏈或分枝的無取代的或經取代的 C₃-C₇-環烷基-C₁-C₃-烷基、直-鏈或分枝的無取代的或經取代的 C₃-C₇-烯基、直-鏈或分枝的無取代的或經取代的 C₃-C₇-炔基、直-鏈或

分枝的無取代的或經取代的 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、直-鏈或分枝的無取代的或經取代的 C_1-C_4 -鹵基烷氧基- C_1-C_4 -烷基、2-甲基-1-(甲基硫烷基)丙烷-2-基或氧雜環丁烷-3-基，

或

R^8 及 R^9 一起與其附接的氮原子形成一種無取代的或經取代的 3-至 7-成員的飽和的環，其可含有至高達 1 個另外挑選自包括氧、硫及氮原子之雜原子，

● R^{10} 為相同或相異基且代表氫、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -鹵基烷基、無取代的或經取代的 C_3-C_6 -環烷基、 C_1-C_4 -三烷基矽烷基、無取代的或經取代的 C_2-C_4 -烯基、無取代的或經取代的 C_2-C_4 -炔基、無取代的或經取代的 苯基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基硫- C_1-C_4 -烷基、無取代的或經取代的 苯甲基或一種 3-至 7-成員的無取代的或經取代的飽和的或不飽和的環，其可不含有或含有至高達 4 個挑選自包括 N、O 及 S 之雜原子，其中兩個氧原子不為相鄰，

或，

● 如果兩個 R^{10} 基係附接至氮原子，兩個 R^{10} 基可形成一種 3-至 7-成員的無取代的或經取代的飽和的或不飽和的環，其可含有至高達 4 個挑選自包括 N、O 及 S 之另外的雜原子，其中兩個氧原子不相鄰，

或

如果兩個 R^{10} 基相鄰成為 $NR^{10}COR^{10}$ 基，兩個 R^{10} 基可形成一種 3-至 7-成員的無取代的或經取代的飽和的或不飽和的環，其可含有至高達 4 個挑選自包括 N、O 及 S 之另外的雜原子，其中兩個氧原子不相鄰，

R^{11} 為相同的或相異之基且代表 C_1 - C_8 -烷基、 C_1 - C_8 -鹵基烷基、 C_1 - C_4 -三烷基矽烷基、無取代的或經取代的 C_2 - C_6 -烯基、無取代的或經取代的 C_2 - C_6 -炔基、無取代的或經取代的 C_3 - C_6 -環烷基、無取代的或經取代的芳基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、無取代的或經取代的苯甲基或一種 3- 至 7-成員的無取代的或經取代的飽和的或不飽和的環，其可能不含有或含有至高達 4 個挑選自包括 N、O 及 S 之雜原子，其中兩個氧原子不相鄰，

在 R^{10} 上之取代基，彼此獨立地為挑選自包括下述基：

甲基、乙基、異丙基、環丙基、氟、氯及溴原子、甲氧基、乙氧基、甲基氫硫基、乙基氫硫基、氰基、羥基及 CF_3 ，

以及其農業化學上之活性鹽類。

本發明也提供式(I)的化合物作為殺真菌劑類之用途。

根據本發明之式(I)的噻吩基胺基嘧啶及其農業化學上之活性鹽類極適合用於控制病原性有害的真菌。上述根據本發明的化合物具有特別是殺真菌的活性且可被使用於作物保護、家戶及衛生領域及材料保護兩者。

式(I)的化合物可為純態物質或為各種可能的異構物之混合物型態呈現，特別是立體異構物，例如，E 及 Z、蘇式及赤式、以及光學異構物類，例如，R 及 S 異構物類或構形異構物類，且，適當的，也包括互變異構物類。所主張的化合物包括 E 及 Z 異構物類、及蘇式與赤式、及光學異構物類、這些異構物之混合物、以及可能的互變異構物型式。

較佳的式(I)化合物，其中一或多個符號具有下述之一的定義：

X^1 代表硫或 CR^1 ，

X^2 代表硫或 CR^2 ，

其中恰好的 X^1 及 X^2 基之一代表一個硫原子，

R^1 代表氫、甲基、甲氧基或 Cl，

如果 X^2 代表 CR^2 ，

R^2 及 R^3 彼此獨立地代表氫、鹵素、CN、硝基、羥基、O- C_1 - C_4 -烷基、O-(C_1 - C_3 -鹵基烷基)、O-(C_3 - C_6 -環烷基)、O- C_2 - C_4 -烯基、O- C_2 - C_4 -炔基、O(CH₂)_mO(C_1 - C_4 -烷基)、OPh、OCO(C_1 - C_4 -烷基)、SH、S- C_1 - C_4 -烷基、S- C_1 - C_3 -鹵基烷基、SPh、SO(C_1 - C_4 -烷基)、SO₂(C_1 - C_4 -烷基)、SO₂(C_1 - C_3 -鹵基烷基)、SO₂(C_2 - C_4 -烯基)、SO₂(C_2 - C_4 -炔基)、CHO、CO(C_1 - C_4 -烷基)、CH=NO(C_1 - C_4 -烷基)、C(C_1 - C_4 -烷基)=NO(C_1 - C_4 -烷基)、CONH(C_1 - C_4 -烷基)、CON(C_1 - C_4 -烷基)₂、CON(SiMe₃)₂、CONH(C_1 - C_3 -鹵基烷基)、CONH(C_2 - C_4 -烯基)、CONH(C_2 - C_4 -炔基)、CONH(C_3 - C_6 -環烷基)、CONHCH₂C(=CH₂)CH₃、CONHCH(CH₃)CH₂O(C_1 - C_4 -烷基)、CONH(CH₂)_mO(C_1 - C_4 -烷基)、CONH(CH₂)_mS(C_1 - C_4 -烷基)、CONHCH(CH₃)CH₂S(C_1 - C_4 -烷基)、CONHPh、吡咯啉-1-基羰基、六氫吡啶-1-基羰基、(4-甲基六氫吡啶-1-基)羰基、雜氮環丁烷-1-基羰基、氮丙啶-1-基羰基、六亞甲基亞胺-1-基-羰基、嗎啉-1-基羰基、硫嗎啉-1-基羰基、COOH、COCl、(C_1 - C_4 -烷氧基)羰基、NHCO(C_1 - C_4 -烷基)、NHCO(C_1 - C_4 -鹵基烷基)、N(C_1 - C_2 -烷基)CO(C_1 - C_4 -烷基)、NHCO(C_2 - C_4 -烯基)、NHCOPh、NHCO(C=CH₂)CH₃、NHCON(C_1 - C_4 -烷基)₂、NHCO(CH₂)_mO(C_1 - C_4 -烷基)、NHCHO、N(C_1 - C_4 -烷基)CHO、NH₂、NH(C_1 - C_4 -烷基)、N(C_1 - C_4 -烷基)₂、NHCH(C_1 - C_4 -烷基)CH₂O(C_1 - C_4 -烷基)、

$(\text{CH}_2)_m\text{CN}$ 、 $(\text{CH}_2)_m\text{SO}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $(\text{CH}_2)_m\text{SO}_2(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、
 $(\text{CH}_2)_m\text{CO}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $(\text{CH}_2)_m\text{O}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{O}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、
 $(\text{CH}_2)_m\text{C}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})_2\text{O}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 CH_2OH 、
 $(\text{CH}_2)_m\text{S}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{S}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $(\text{CH}_2)_m\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、
 $(\text{CH}_2)_m\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})_2$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-環烷基}$ 或 $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-鹵基烷基}$ ，

其中，如果 X^2 代表一個硫原子，上述的定義僅適用於 R^3 且 m 相當於 1 至 4 之數目，

R^4 代表氫、甲基、甲氧基、氯或氟，

R^5 代表氫、Me、COMe、CHO、 $\text{COCH}_2\text{OCH}_3$ 、 CH_2OCH_3 、
 COOMe 、 COOEt 、 COOtertBu 、 COOBn 、 COCF_3 、
 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 SOCH_3 、 SO_2CH_3 或苯甲基，

R^6 代表氫、氰基、甲基、 CF_3 或 CFH_2 ，

R^7 代表氟、氯、溴、碘、甲基、 OCF_3 或 CF_3 ，

R^8 代表氫、甲基、乙基、丙基、丙-2-基、2-甲氧基乙烷-1-基、丙-2-烯-1-基、 CH_2OCH_3 、 COH 、COMe、 COOMe 、 COOEt 、
 COOtertBu 、 COCF_3 或苯甲基，

R^9 代表直-鏈或分枝的無取代的或經取代的 $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-烷基}$ 、無取代的或經取代的 $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-環烷基}$ 、直-鏈或分枝的無取代的或經取代的 $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-環烷基-C}_1\text{-C}_2\text{-烷基}$ 、無取代的或經取代的 $\text{C}_2\text{-C}_5\text{-鹵基烷基}$ 、直-鏈或分枝的無取代的或經取代的 $\text{C}_3\text{-C}_5\text{-烯基}$ 或 2-甲基-1-(甲基硫烷基)丙烷-2-基，

其中在 R^9 中之取代基彼此獨立地為挑選自包括下述基：甲基、乙基、異丙基、環丙基、氟、氯及溴原子、甲氧基、乙氧基、甲基氫硫基、

乙基氫硫基、氰基、羥基及 CF_3 ，

以及其農業化學上之活性鹽類。

特別佳的式(I)化合物，其中一或多個的符號具有下述之意義：

X^1 代表硫或 CR^1 ，

X^2 代表硫或 CR^2 ，

其中恰好地， X^1 及 X^2 基之一為硫原子，

R^1 代表氫，

如果 X^2 代表 CR^2 ，

R^2 及 R^3 彼此獨立地代表氫、 COOMe 、 COOEt 、 COOPr 、 $\text{COO}i\text{Pr}$ 、

$\text{CONH}(\text{C}_4\text{H}_9)$ 、 $\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{OMe}$ 、 $\text{CONHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{OMe}$ 、

CONHOH 、 CONHMe 、 CONHEt 、 CONHPr 、 $\text{CONH}i\text{Pr}$ 、

$\text{CONH}(i\text{-C}_4\text{H}_9)$ 、 CONHPh 、 $\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{SCH}_3$ 、

$\text{CONHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SCH}_3$ 、 $\text{CONHCH}_2\text{CF}_3$ 、

$\text{CONHCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CONHCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CONMeCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、

$\text{CONHCH}_2\text{C}(=\text{CH}_2)\text{CH}_3$ 、 CONHPh 、 CONH 環丙基、

$\text{CON}(\text{Me})i\text{C}_3\text{H}_7$ 、 $\text{CON}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CON}(\text{Et})_2$ 、 $\text{CON}(\text{Me})$

環丙基甲基、 $\text{CON}(\text{Me})$ 環丁基甲基、 $\text{CON}(\text{Ph})_2$ 、 $\text{CON}(\text{Me})_2$ 、

$\text{CON}(\text{Pr})_2$ 、吡咯啉-1-基羰基、六氫吡啶-1-基羰基、(4-甲基六氫

吡啶-1-基)羰基、雜氮環丁烷-1-基羰基、氮丙啶-1-基-羰基、六

亞甲基亞胺-1-基羰基、嗎啉-1-基羰基、硫嗎啉-1-基羰基、

$\text{CON}(\text{SiMe}_3)_2$ 、 COMe 、 COEt 、 COPr 、 CN 、 $\text{C}(=\text{NOCH}_3)\text{Me}$ 、

$\text{C}(=\text{NOEt})\text{Me}$ 、 $\text{C}(=\text{NOPr})\text{Me}$ 、氯、溴、碘、硝基、 SH 、 SMe 、

SEt 、 SPr 、 SCF_3 、 SPh 、 COOH 、 Me 、 Et 、 Pr 、 SO_2Me 、

SO_2Et 、 CH_2OMe 或 CH_2OEt ，

其中，如果 X^2 代表一個硫原子，上述的定義僅適用於 R^3 ，

R^4 代表氫，

R^5 代表氫、COMe、CHO、 CH_2OCH_3 、COOMe 或 $CH_2C\equiv CH$ ，

R^6 代表氫，

R^7 代表氟、氯、溴、碘、 OCF_3 或 CF_3 ，

R^8 代表氫或甲基，

R^9 代表環丙基、環丁基、2-甲基環丙-1-基、2-甲基環丁-1-基、3-甲基環丁-1-基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、異丙基、環丙基甲基、甲基、乙基、2,2-二甲基環丙基、環戊基、丙-2-基、丙-2-烯-1-基、丁-2-基、1-甲氧基丙-2-基、2-甲基-1-(甲基硫烷基)丙-2-基、氧雜環丁烷-3-基、1,1,1-三氟丙烷-2-基或 2,2,3,3,3-五氟丙基、

以及其農業化學上之活性鹽類。

極佳的式(I)化合物為其中一或多個符號具有下述定義之一：

X^1 代表硫或 CR^1 ，

X^2 代表硫或 CR^2 ，

其中恰好地 X^1 及 X^2 基之一代表一個硫原子，

R^1 代表氫，

如果 X^2 代表 CR^2 ，

R^2 及 R^3 彼此獨立地代表氫、 CH_3 、COOMe、 $CONH(tert-C_4H_9)$ 、

$CONH(CH_2)_2OMe$ 、 $CONHCH(CH_3)CH_2OMe$ 、 $CONHOH$ 、

$CON(Me)iC_3H_7$ 、 $CON(Me)CH_2CH=CH_2$ 、 $CON(Et)_2$ 、CON 基環丙基甲基、吡咯啉-1-基羰基、六氫吡啶-1-基羰基、嗎啉-1-基羰基、COMe、CN、 $C(=NOCH_3)CH_3$ 、氯、溴、SMe、

CONHCH₂CF₃、CONHCH₂CH=CH₂、CONHCH₂C≡CH、
CONMeCH₂C≡CH、CONHCH₂C(=CH₂)CH₃、CONHPh、CONH
環丙基、(4-甲基六氫吡咩-1-基)羰基、COOH 或 SO₂Me，

其中，如果 X² 代表一個硫原子，上述的定義僅適用於 R³，

R⁴ 代表氫，

R⁵ 代表氫，

R⁶ 代表氫，

R⁷ 代表氯、溴、或 CF₃，

R⁸ 代表氫，

R⁹ 代表環丙基、環丁基、2-甲基環丙-1-基、2-甲基環丁-1-基、3-甲
基環丁-1-基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、異丙基或環丙基
甲基，

以及其農業化學上之活性鹽類。

極佳的式(I)化合物也為其中一或多個符號具有下述定義之一：

X¹ 代表硫，

X² 代表 CR²，

R² 代表氫、CH₃、COOMe、CONH(CH₂)₂OMe、COMe、SMe、
SO₂Me 或 CN，

R³ 代表氫或 CN，

或

X¹ 代表 CR¹，

X² 代表硫，

R¹ 代表氫，

R³ 代表氫、COOMe、CON(Me)(iC₃H₇)、CONH(*tert*-C₄H₉)、

CONH(CH₂)₂OMe、CONHCH(CH₃)CH₂OMe、CONHOH、
CON(Me)CH₂CH=CH₂、CONHCH₂CH=CH₂、CON(Et)₂、吡咯
啉-1-基羰基、六氫吡啶-1-基羰基、嗎啉-1-基羰基、COMe 或
CN，

R⁴ 代表氫，

R⁵ 代表氫，

R⁶ 代表氫，

R⁷ 代表氯、溴、或 CF₃，

R⁸ 代表氫，

R⁹ 代表環丙基、環丁基、2-甲基環丙-1-基、2-甲基環丁-1-基、3-甲
基環丁-1-基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、異丙基或環丙基
甲基，

以及其農業化學上之活性鹽類。

較佳者也為式(I)的化合物，其中

X¹ 代表一個硫原子，

其中其他的取代基具有一或多個上述之定義，

以及其農業化學上之活性鹽類。

較佳者也為式(I)的化合物，其中

X² 代表一個硫原子，

其中其他的取代基具有一或多個上述之定義，

以及其農業化學上之活性鹽類。

較佳者也為式(I)的化合物，其中

X² 代表一個硫原子，且

R¹ 及 R⁵ 兩者代表氫，

其中其他的取代基具有一或多個上述之定義，
 以及其農業化學上之活性鹽類。

較佳者也為式(I)的化合物，其中

R^2 代表氫、 CH_3 、 $COOMe$ 、 $CONH(C_4H_9)$ 、 $CONH(CH_2)_2OMe$ 、
 $CONHCH(CH_3)CH_2OMe$ 、 $CONHOH$ 、 $CON(Me)iC_3H_7$ 、
 $CON(Me)CH_2CH=CH_2$ 、 $CON(Et)_2$ 、 CON 甲基環丙基甲基、吡
 咯啉-1-基羰基、六氫吡啶-1-基羰基、嗎啉-1-基羰基、 $COMe$ 、
 CN 、 $C(=NOCH_3)CH_3$ 、氯、溴、 SMe 、 $CONHCH_2CF_3$ 、
 $CONHCH_2CH=CH_2$ 、 $CONHCH_2C\equiv CH$ 、 $CONMeCH_2C\equiv CH$ 、
 $CONHCH_2C(=CH_2)CH_3$ 、 $CONHPh$ 、 $CONH$ 環丙基、(4-甲基六
 氫吡啶-1-基)羰基、 $COOH$ 或 SO_2Me ，

其中其他的取代基具有一或多個上述之定義，
 以及其農業化學上之活性鹽類。

較佳者也為式(I)的化合物，其中

R^3 代表氫、 CH_3 、 $COOMe$ 、 $CONH(C_4H_9)$ 、 $CONH(CH_2)_2OMe$ 、
 $CONHCH(CH_3)CH_2OMe$ 、 $CONHOH$ 、 $CON(Me)iC_3H_7$ 、
 $CON(Me)CH_2CH=CH_2$ 、 $CON(Et)_2$ 、 CON 甲基環丙基甲基、吡咯
 啉-1-基羰基、六氫吡啶-1-基羰基、嗎啉-1-基羰基、 $COMe$ 、
 CN 、 $C(=NOCH_3)CH_3$ 、氯、溴、 SMe 、 $CONHCH_2CF_3$ 、
 $CONHCH_2CH=CH_2$ 、 $CONHCH_2C\equiv CH$ 、 $CONMeCH_2C\equiv CH$ 、
 $CONHCH_2C(=CH_2)CH_3$ 、 $CONHPh$ 、 $CONH$ 環丙基、(4-甲基六
 氫吡啶-1-基)羰基、 $COOH$ 或 SO_2Me ，

其中其他的取代基具有一或多個上述之定義，
 以及其農業化學上之活性鹽類。

較佳者也為式(I)的化合物，其中

R^4 代表氫，

其中其他的取代基具有一或多個上述之定義，
以及其農業化學上之活性鹽類。

較佳者也為式(I)的化合物，其中

R^5 代表氫，

其中其他的取代基具有一或多個上述之定義，
以及其農業化學上之活性鹽類。

較佳者也為式(I)之化合物，其中

R^6 代表氫，

其中其他的取代基具有一或多個上述之定義，
以及其農業化學上之活性鹽類。

較佳者也為式(I)之化合物，其中

R^7 代表 Cl、Br 或 CF_3 ，

其中其他的取代基具有一或多個上述之定義，
以及其農業化學上之活性鹽類。

較佳者也為式(I)之化合物，其中

R^8 代表氫或甲基，

其中其他的取代基具有一或多個上述之定義，
以及其農業化學上之活性鹽類。

較佳者也為式(I)之化合物，其中

R^9 代表環丙基、環丁基、2-甲基環丙-1-基、2-甲基環丁-1-基、3-甲基環丁-1-基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、異丙基或環丙基甲基，

其中其他的取代基具有一或多個上述之定義，
 以及其農業化學上之活性鹽類。

較佳者也為式(I)之化合物，其中

X^1 代表 CR^1 且

R^1 、 R^4 、 R^5 及 R^6 代表氫，

其中其他的取代基具有一或多個上述之定義，
 以及其農業化學上之活性鹽類。

上述所給之基的定義可視需要彼此被組合。此外，個別的定義可能不被應用。

無機酸類之實例為氫鹵酸類，例如，氟化氫、氯化氫、溴化氫及碘化氫、硫酸、磷酸及硝酸、及酸性鹽類，例如 $NaHSO_4$ 及 $KHSO_4$ 。適當的有機酸類為，例如，甲酸、碳酸及烷酸類，例如，乙酸、三氟乙酸、三氯乙酸及丙酸、以及羥基乙酸、硫氰酸、乳酸、琥珀酸、檸檬酸、苯甲酸、肉桂酸、草酸、烷基磺酸類(具有 1 至 20 個碳原子之直-鏈或分枝的烷基之磺酸類)、芳基磺酸類或芳基二磺酸類(攜帶一或兩個磺酸基之芳族基，例如，苯基及萘基)、烷基膦酸類(具有 1 至 20 個碳原子之直-鏈或分枝的烷基之膦酸類)、芳基膦酸類或芳基二膦酸類(攜帶一或兩個膦酸基之芳族基，例如，苯基及萘基)，其中烷基及芳基可另外再攜帶取代基，例如對-甲苯磺酸、水楊酸、對-胺基水楊酸、2-苯氧基苯甲酸、2-乙酸基苯甲酸、等等。

適當的金屬離子為，特別是第二主族元素之離子，特別是鈣及鎂，第三及第四主族元素之離子，特別是鋁，錫及鉛，以及第 1 至第 8 族過渡金屬，特別是鉻、錳、鐵、鈷、鎳、銅、鋅等等。特別佳者係第四周期的元素之金屬離子。在此，金屬可以其可呈現之各種的價

數存在。

選擇地經取代的基可為經單-或多-取代的，在經多取代的情況下，取代基可為相同或相異。

上述式中所給符號中，所使用的共同名稱通常代表下述的取代基：

鹵素：氟、氯、溴及碘；

芳基：一種無取代的或選擇地經取代之 5-至 15-成員的部分地或完全地不飽和的單-、雙-或三環狀環系，其具有至高達 3 個環成員為挑選自 C(=O)、(C=S)基，其中環系中之至少一個環為完全地無取代的，例如(但不限於)苯、萘、四氫萘、蒽、茚滿、菲(phenanthrene)、甘菊藍；

烷基：具有 1 至 10 個碳原子之飽和的直-鏈或分枝的烴基，例如(但不限於)甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基-丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基及 1-乙基-2-甲基丙基、庚基、1-甲基己基、辛基、1,1-二甲基己基、2-乙基己基、1-乙基己基、壬基、1,2,2-三甲基己基、癸基；

鹵基烷基：具有 1 至 4 個碳原子之直-鏈或分枝的烷基(如前面所提的)，其中各基中之一些或全部的氫原子可如上述般的被鹵素原子取代，例如(但不限於)，C₁-C₂-鹵基烷基，例如氯甲基、溴甲基、二氯

甲基、三氯甲基、氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氯氯甲基、二氯氯甲基、氯二氯甲基、1-氯乙基、1-溴乙基、1-氯乙基、2-氯乙基、2,2-二氯乙基、2,2,2-三氯乙基、2-氯-2-氯乙基、2-氯-2-二氯乙基、2,2-二氯-2-氯乙基、2,2,2-三氯乙基、五氯乙基及 1,1,1-三氯丙-2-基;

烯基: 具有 2 至 16 個碳原子與至少一個雙鍵於任一位置之直-鏈或分枝的烴基, 例如(但不限於), C_2 - C_6 -烯基, 例如, 乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-1-丁烯基、2-甲基-1-丁烯基、3-甲基-1-丁烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、1,2-二甲基-1-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-1-戊烯基、2-甲基-1-戊烯基、3-甲基-1-戊烯基、4-甲基-1-戊烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-2-戊烯基、4-甲基-2-戊烯基、1-甲基-3-戊烯基、2-甲基-3-戊烯基、3-甲基-3-戊烯基、4-甲基-3-戊烯基、1-甲基-4-戊烯基、2-甲基-4-戊烯基、3-甲基-4-戊烯基、4-甲基-4-戊烯基、1,1-二甲基-2-丁烯基、1,1-二甲基-3-丁烯基、1,2-二甲基-1-丁烯基、1,2-二甲基-2-丁烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,3-二甲基-1-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、1,3-二甲基-3-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-1-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、3,3-二甲基-1-丁烯基、3,3-二甲基-2-丁烯基、1-乙基-1-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-乙基-1-丁烯基、2-乙基-2-丁烯基、2-乙基-3-

丁烯基、1,1,2-三甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯基、1-乙基-2-甲基-1-丙烯基及 1-乙基-2-甲基-2-丙烯基;

炔基: 具有 2 至 16 個碳原子與至少一個三鍵於任一位置之直-鏈或分枝的烴基，例如(但不限於)， C_2 - C_6 -炔基，例如，乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、3-甲基-1-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基、1-乙基-2-丙炔基、1-己炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、1-甲基-2-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-3-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、3-甲基-1-戊炔基、3-甲基-4-戊炔基、4-甲基-1-戊炔基、4-甲基-2-戊炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-3-丁炔基、1,2-二甲基-3-丁炔基、2,2-二甲基-3-丁炔基、3,3-二甲基-1-丁炔基、1-乙基-2-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-乙基-3-丁炔基及 1-乙基-1-甲基-2-丙炔基;

烷氧基: 具有 1 至 4 個碳原子之飽和的直-鏈或分枝的烷氧基，例如(但不限於)， C_1 - C_4 -烷氧基，例如，甲氧基、乙氧基、丙氧基、1-甲基乙氧基、丁氧基、1-甲基-丙氧基、2-甲基丙氧基、1,1-二甲基乙氧基;

鹵基烷氧基: 具有 1 至 4 個碳原子之直-鏈或分枝的烷氧基(如前所述者)，其中在這些基上的一些或全部的氫原子可如上述般的被鹵素原子取代，例如(但不限於)， C_1 - C_2 -鹵基烷氧基，例如，氯甲氧基、溴甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、1-氯乙氧基、1-溴乙氧基、1-氟乙氧基、2-氟乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙

氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-tri 氯乙氧基、五氟乙氧基及 1,1,1-三氟丙-2-氧基;

硫代烷基: 具有 1 至 6 個碳原子之飽和的直-鏈或分枝的烷基硫基，例如(但不限於)， C_1 - C_6 -烷基硫基，例如，甲基硫基、乙基硫基、丙基硫基、1-甲基乙基硫基、丁基硫基、1-甲基丙基硫基、2-甲基丙基硫基、1,1-二甲基乙基硫基、戊基硫基、1-甲基丁基硫基、2-甲基丁基硫基、3-甲基丁基硫基、2,2-二甲基丙基硫基、1-乙基丙基硫基、己基硫基、1,1-二甲基丙基硫基、1,2-二甲基丙基硫基、1-甲基戊基硫基、2-甲基戊基硫基、3-甲基戊基硫基、4-甲基戊基硫基、1,1-二甲基丁基硫基、1,2-二甲基丁基硫基、1,3-二甲基丁基硫基、2,2-二甲基丁基硫基、2,3-二甲基丁基硫基、3,3-二甲基丁基硫基、1-乙基丁基硫基、2-乙基丁基硫基、1,1,2-三甲基丙基硫基、1,2,2-三甲基丙基硫基、1-乙基-1-甲基丙基硫基及 1-乙基-2-甲基丙基硫基;

硫代鹵基烷基: 具有 1 至 6 個碳原子之直-鏈或分枝的烷基硫基(如前面所提的)，其中在這些基上之一些或全部的氫原子可如同上述般地被鹵素原子取代，例如(但不限於) C_1 - C_2 -鹵基烷基硫基，例如，氯甲基硫基、溴甲基硫基、二氯甲基硫基、三氯甲基硫基、氟甲基硫基、二氟甲基硫基、三氟甲基硫基、氯氟甲基硫基、二氯氟甲基硫基、氯二氟甲基硫基、1-氯乙基硫基、1-溴乙基硫基、1-氟乙基硫基、2-氟乙基硫基、2,2-二氟乙基硫基、2,2,2-三氟乙基硫基、2-氯-2-氟乙基硫基、2-氯-2,2-二氟乙基硫基、2,2-二氯-2-氟乙基硫基、2,2,2-三氯乙基硫基、五氟乙基硫基及 1,1,1-三氟丙-2-基硫基;

環烷基: 具有 3 至 10 個碳環成員之單-、雙-或三環狀飽和的烴基，例如(但不限於)，環丙基、環丁基、環戊基及環己基、雙環并[1,0,1]丁

烷、十氫萘基、正冰片基;

環烯基: 具有 5 至 15 個碳環成員與至少一個雙鍵之單-、雙-或三環狀之非-芳族的烴基，例如(但不限於)，環戊烯-1-基、環己烯-1-基、環庚-1,3-二烯-1-基、正冰片烯-1-基;

(烷氧基)羰基: 具有 1 至 4 個碳原子的一種烷氧基(如上所述者)，其經由一種羰基(-CO-)被附接在骨架上;

雜環基: 含有 1 至 4 個挑選自包括氧、氮與硫，具有 3-至 15-個成員的飽和的或部分地不飽和的雜環: 單-、雙-或三環性雜環，除了碳環成員外，含有 1 至 3 個氮原子及/或 1 個氧或硫原子或 1 或 2 個氧及/或硫原子; 如果環含有多數的氧原子，其不可為直接地相鄰; 例如(但不限於)，環氧乙烷基、氮丙啶基、2-四氫呋喃基、3-四氫呋喃基、2-四氫噻吩基、3-四氫噻吩基、2-吡咯啶基、3-吡咯啶基、3-異噁唑啶基、4-異噁唑啶基、5-異噁唑啶基、3-異噻唑啶基、4-異噻唑啶基、5-異噻唑啶基、3-吡唑啶基、4-吡唑啶基、5-吡唑啶基、2-噁唑啶基、4-噁唑啶基、5-噁唑啶基、2-噻唑啶基、4-噻唑啶基、5-噻唑啶基、2-咪唑啶基、4-咪唑啶基、1,2,4-噁二唑啶-3-基、1,2,4-噁二唑啶-5-基、1,2,4-噻二唑啶-3-基、1,2,4-噻二唑啶-5-基、1,2,4-三唑啶-3-基、1,3,4-噁二唑啶-2-基、1,3,4-噻二唑啶-2-基、1,3,4-三唑啶-2-基、2,3-二氫呋喃-2-基、2,3-二氫呋喃-3-基、2,4-二氫呋喃-2-基、2,4-二氫呋喃-3-基、2,3-二氫噻吩-2-基、2,3-二氫噻吩-3-基、2,4-二氫噻吩-2-基、2,4-二氫噻吩-3-基、2-吡咯啉-2-基、2-吡咯啉-3-基、3-吡咯啉-2-基、3-吡咯啉-3-基、2-異噁唑啉-3-基、3-異噁唑啉-3-基、4-異噁唑啉-3-基、2-異噁唑啉-4-基、3-異噁唑啉-4-基、4-異噁唑啉-4-基、2-異噁唑啉-5-基、3-異噁唑啉-5-基、4-異噁唑啉-5-基、2-異噻唑啉-3-

基、3-異噻唑啉-3-基、4-異噻唑啉-3-基、2-異噻唑啉-4-基、3-異噻唑啉-4-基、4-異噻唑啉-4-基、2-異噻唑啉-5-基、3-異噻唑啉-5-基、4-異噻唑啉-5-基、2,3-二氫吡唑-1-基、2,3-二氫吡唑-2-基、2,3-二氫吡唑-3-基、2,3-二氫吡唑-4-基、2,3-二氫吡唑-5-基、3,4-二氫吡唑-1-基、3,4-二氫吡唑-3-基、3,4-二氫吡唑-4-基、3,4-二氫吡唑-5-基、4,5-二氫吡唑-1-基、4,5-二氫吡唑-3-基、4,5-二氫吡唑-4-基、4,5-二氫吡唑-5-基、2,3-二氫噁唑-2-基、2,3-二氫噁唑-3-基、2,3-二氫噁唑-4-基、2,3-二氫噁唑-5-基、3,4-二氫噁唑-2-基、3,4-二氫噁唑-3-基、3,4-二氫噁唑-4-基、3,4-二氫噁唑-5-基、3,4-二氫噁唑-2-基、3,4-二氫噁唑-3-基、3,4-二氫噁唑-4-基、2-六氫吡啶基、3-六氫吡啶基、4-六氫吡啶基、1,3-環氧已烷-5-基、2-四氫吡喃基、4-四氫吡喃基、2-四氫噻吩基、3-六氫-嗒吡基、4-六氫嗒吡基、2-六氫嘧啶基、4-六氫嘧啶基、5-六氫嘧啶基、2-六氫吡嗪基、1,3,5-六氫-三吡-2-基及 1,2,4-六氫三吡-3-基;

雜芳基: 無取代的或選擇地經取代的 5-至 15-成員的 部分地或全部地無取代的單-、雙-或三環系，其中環系中之至少一個環為完全地無取代的，包含 1 至 4 個挑選自包括氧、氮及硫之雜原子，如果環含有多個氧原子，它們不可直接地相鄰;

例如 (但不限於)，

- 5-成員的 雜芳基，含有 1 至 4 個氮原子或 1 至 3 個氮原子及一個硫或氧原子: 5-成員的 雜芳基，其除了碳原子外，可含有 1 至 4 個氮原子或 1 至 3 個氮原子及一個硫或氧原子作為環成員，例如 2-呋喃基、3-呋喃基、2-噻吩基、3-噻吩基、2-吡咯基、3-吡咯基、3-異噁唑基、4-異噁唑基、5-異噁唑基、3-異噻唑基、4-

異噻唑基、5-異噻唑基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡唑基、2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基、2-噻唑基、4-噻唑基、5-噻唑基、2-咪唑基、4-咪唑基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1,2,4-三唑-3-基、1,3,4-噁二唑-2-基、1,3,4-噻二唑-2-基及 1,3,4-三唑-2-基;

- 苯并-稠合的 5-成員的雜芳基，含有 1 至 3 個氮原子或 1 個氮原子及一個氧或硫原子: 5-成員的雜芳基，其除了碳原子外，可含有 1 至 4 個氮原子或 1 至 3 個氮原子及一個硫或氧原子作為環成員，且其中兩相鄰的碳環成員或一個氮及一個相鄰的碳環成員可經由一種丁-1,3-二烯-1,4-二基構成架橋，其中 1 或 2 個碳原子可被取代成氮原子; 例如苯并吡啶基、苯并咪唑基、苯并噻唑基、苯并吡唑基、苯并呋喃基;
- 含有 1 至 4 個氮原子且係經由氮原子被附接之 5-成員的雜芳基，或含有 1 至 3 個氮原子且係經由氮原子被附接之 5-成員的苯并稠合的雜芳基: 5-成員的雜芳基，其除了碳原子外，可含有 1 至 4 個氮原子或 1 至 3 個氮原子作為環成員且其中兩相鄰的碳環成員可經由一種丁-1,3-二烯-1,4-二基構成架橋，其中 1 或 2 個碳原子可被取代成氮原子，其中這些環經由氮環原子之一被附接至骨架，例如 1-吡咯基、1-吡唑基、1,2,4-三唑-1-基、1-咪唑基、1,2,3-三唑-1-基、1,3,4-三唑-1-基;
- 含有 1 至 3 或 1 至 4 個氮原子之 6-成員的雜芳基: 6-成員的雜芳基，其除了碳原子外，可含有 1 至 3 個或 1 至 4 個氮原子作為環成員，例如 2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、3-嘧啶基、4-嘧啶基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、5-嘧啶基、2-吡嗪基、1,3,5-三吡-2-基

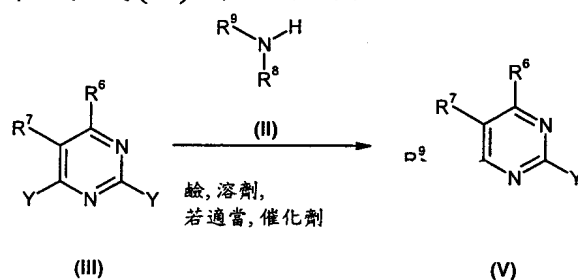
及 1,2,4-三吡-3-基。

未被包含在內者為與自然法則相矛盾之組合且為本技藝的行家根據其專業知識會予以排除之化合物。被排除者為，例如，具有 3 個或多個相鄰的氧原子之環結構。

【實施方式】

本發明也關於製備根據本發明之式(I)之噻吩基胺基嘧啶的方法，包含至少一個下述(a)至(e)的步驟之一：

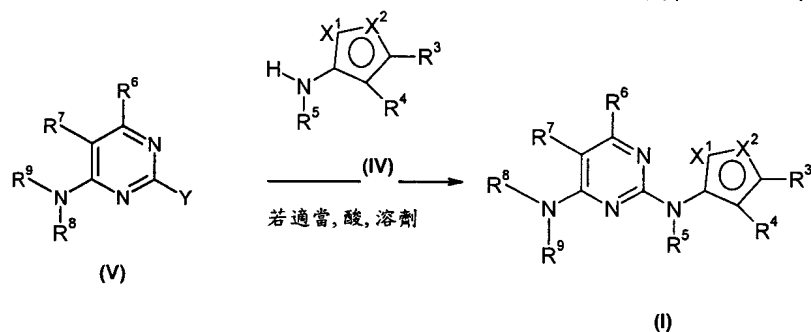
- (a) 根據下述反應圖示(圖示 1)，令式(III)的 2,4-二鹵基嘧啶與式(II)的胺，在鹼存在下，適當地於種溶劑內，適當地在催化劑存在下進行反應，製得式(V)的化合物：



圖示 1

其中 Y = F、Cl、Br、I

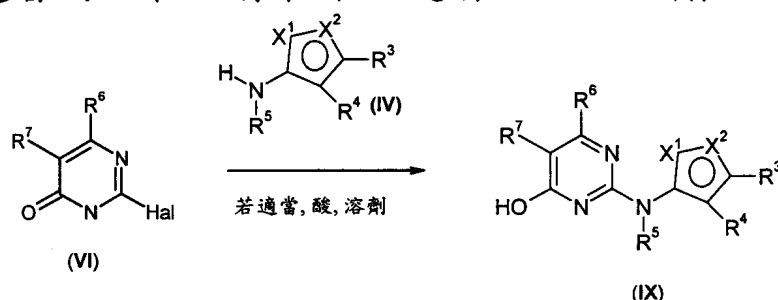
- (b) 根據下述反應圖示(圖示 2)，令式(V)的化合物與式(IV)的胺基噻吩，適當的，在酸存在下，適當地，於溶劑內進行反應：



圖示 2

其中 Y = F、Cl、Br、I

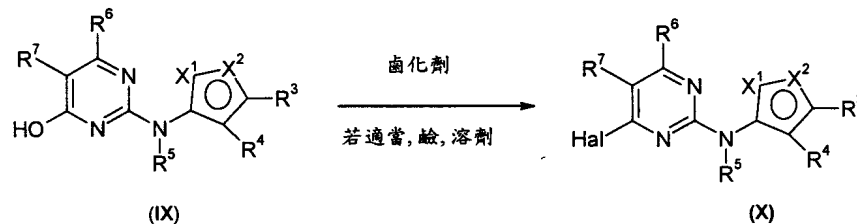
- (c) 根據下述反應圖示(圖示 3)，令式(VI)的化合物與式(IV)的胺基噻吩，適當的，在酸存在下，適當地，於溶劑內進行反應：



圖示 3

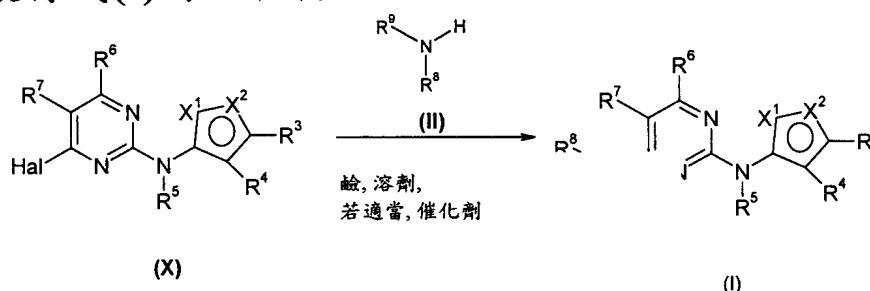
其中 Hal = F、Cl、Br、I

- (d) 根據下述反應圖示(圖示 4)，令式(IX)的化合物與一種鹵化劑，適當地於溶劑內進行反應，製得式(X)的化合物：



圖表 4

- (e) 根據下述反應圖示(圖示 5)，令式(X)的化合物與式(II)的胺，在鹼存在下，適當的於溶劑內，適當的在催化劑存在下進行反應，製得式(I)的化合物：



圖示 5

上述圖示中之 R^1 至 R^9 及 X^1 及 X^2 之定義相當於所給之定義且 Y 及 Hal 代表 F、Cl、Br、I。

製備式(V)的化合物之一種方法被出示於圖示 1。.

式(II)的烷基胺基化合物為可購得或可利用文獻中之方法取得者。製備適當的式(II)類型之環丙基胺基化合物之一種方法為，例如，由適當的羧酸衍生物進行重組，製成相關的胺基化合物(被披露於，例如，*J. Am. Chem. Soc.* **1961**, 83, 3671-3678)中。其他的方法，例如，製備式(II)類型之環丁基胺基化合物，包括，將適當的環丁烯類氮硼化並接著以 $\text{NH}_2\text{SO}_3\text{H}$ 處理(例如，*Tetrahedron* **1970**, 26, 5033-5039)，環丁酮類之還原性胺化作用(被披露於，例如，*J. Org. Chem.* **1964**, 29, 2588-2592中)以及還原硝基-或亞硝基環丁烷類(見，例如，*J. Am. Chem. Soc.* **1953**, 75, 4044; *Can. J. Chem.* **1963**, 41, 863-875)或疊氮基環丁烷類(被披露於，例如，*Chem. Pharm. Bull.* **1990**, 38, 2719-2725; *J. Org. Chem.* **1962**, 27, 1647-1650中)。式(II)的經鹵素取代的胺基化合物為可購得或可利用文獻中之方法取得者。製備適當的式(II)類型之經鹵素取代之胺基化合物之一種方法為，例如，還原相關的羧醯胺類(被披露於，例如，EP30092中)或相關的肟類或疊氮化物類(被披露於，例如，*Chem. Ber.* **1988**, 119, 2233中)或硝基化合物類(被披露於，例如，*J. Am. Chem Soc.* **1953**, 75, 5006中)。另種方法包括以在HF內之 SF_4 處理相關的胺基羧酸類(被披露於，例如，*J. Org. Chem.* **1962**, 27, 1406中)。經取代的氮丙啶類與HF之開環反應被披露於*J. Org. Chem.* **1981**, 46, 4938。用於製備經鹵素取代的胺基化合物類(II)之另外的方法包括斷開相關的酞亞醯胺類，係根據Gabriel之方法(被披露於，例如，DE 3429048中)，適當的鹵基烷基鹵化物類之胺解反應(被披露於，例如，US2539406中)或降解相關的羧酸疊氮化物類(被披露於，例如，DE3611195中)。使用適當的氟化劑類(例如 DAST)，胺基

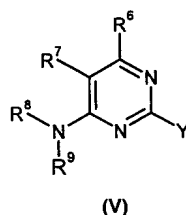
醛類或-酮類可被轉變成相關的二氟烷基胺類(WO2008008022)，其中胺基醇類形成相關的單氟烷基胺類(例如WO2006029115)。類似地，使用適當的氯化劑及溴化劑，可由胺基醇類分別製得氯-及溴烷基胺類(*J. Org. Chem.* **2005**, 70, 7364, 或 *Org. Lett.*, **2004**, 6, 1935)。

適當的經取代的2,4-二鹵基嘧啶類(III)為可購得或可利用文獻中之方法取得者。例如，購入經取代的尿嘧啶(例如 $R^7 = \text{CN}$: *J. Org. Chem.* **1962**, 27, 2264; *J. Chem. Soc.* **1955**, 1834; *Chem. Ber.* **1909**, 42, 734; $R^7 = \text{CF}_3$: *J. Fluorine Chem.* **1996**, 77, 93; 也參考 WO 2000/047539)。

使用一種適當的鹼，在自 -30°C 至 $+80^\circ\text{C}$ 的溫度下，在一種適當的溶劑，例如，二噁烷、THF、二甲基甲醯胺或乙腈內，首先令式(II)的胺與2,4-二鹵基嘧啶(III)反應1-24小時。作為鹼使用之適當者為，例如，無機鹽類，例如 NaHCO_3 、 Na_2CO_3 或 K_2CO_3 、有機金屬化合物類，例如LDA或NaHMDS或胺鹼類，例如乙基二異丙基胺、DBU、DBN或三正丁基胺。或者，此反應也可利用被披露於*Org. Lett.* **2006**, 8, 395中之方法，藉助於適當的過渡金屬催化劑，例如，鈀，一起與一種適當的配體，例如三苯基膦或xanthphos進行反應。

一些式(V)的化合物係新穎的化合物並因此也為本發明主題之一部分。

新穎之式(V)的化合物，其中



R^6 代表氫，

且，如果

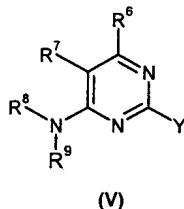
R^7 代表 I、SMe、SOMe、SO₂Me、CF₃、CFH₂ 或 CF₂H，且

Y 代表 F、Cl、Br 或 I，

R^8 代表氫、乙基、丙基、丙-2-基、2-甲氧基乙烷-1-基、丙-2-烯-1-基、CH₂OCH₃、COMe、COOMe、COOEt、COO_{tert}Bu、COCF₃ 或苯甲基，且

R^9 代表環丙基、環丁基、2-甲基環丙-1-基、2-甲基環丁-1-基、3-甲基環丁-1-基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、異丙基、環丙基甲基、甲基、乙基、2,2-二甲基環丙基、環戊基、丙-2-基、丙-2-烯-1-基、丁烷-2-基、1-甲氧基丙-2-基、2-甲基-1-(甲基硫烷基)丙-2-基、1,1,1-三氟丙烷-2-基或 2,2,3,3,3-五氟丙基。

新穎的式(V)化合物，其中



R^6 代表氫，

且，如果

R^7 代表氰基，且

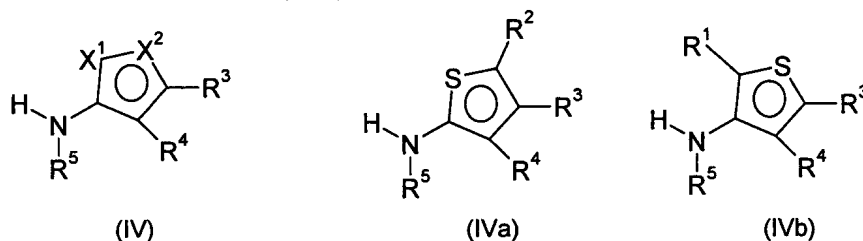
Y 代表 F、Cl、Br 或 I，

R^8 代表氫、甲基、丙基、丙-2-基、2-甲氧基乙烷-1-基、丙-2-烯-1-基、CH₂OCH₃、COMe、COOMe、COOEt、COO_{tert}Bu、COCF₃ 或苯甲基且

R^9 代表環丁基、2-甲基環丙-1-基、2-甲基環丁-1-基、3-甲基環丁-1-基、2,2-二氟乙基、異丙基、環丙基甲基、2,2-二甲基環丙

基、環戊基、丁烷-2-基、1-甲氧基丙-2-基、2-甲基-1-(甲基硫烷基)丙-2-基、1,1,1-三氟丙烷-2-基或 2,2,3,3,3-五氟丙基。

經取代的胺基噻吩類(IV)，在下面也被描述成 IVa 或 IVb，

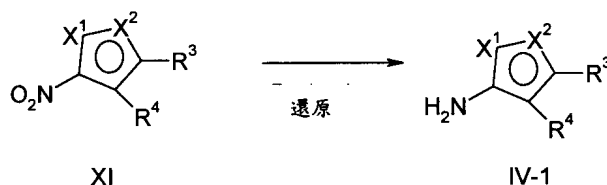


其為可購得或可利用文獻中已知的方法由可購得的前驅物製備得者。

在噻吩部位攜帶一或多個相同或相異取代基之胺基噻吩類，可藉由被披露於有關文獻中之許多種方法製備，藉由實例提及一些方法於後面：

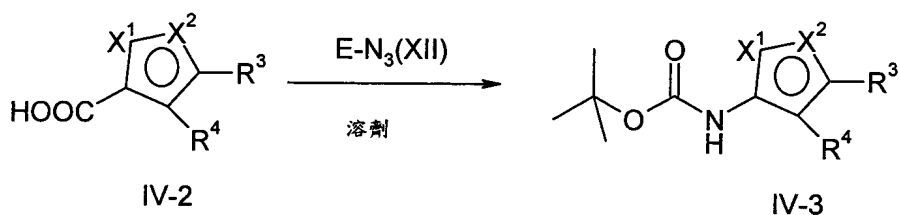
f) 根據下面反應圖表，還原式(XI)之硝基噻吩，在一種還原劑存在下及一種溶劑內進行，製得式(IV-1)之胺基噻吩類，其中 X^1 、 X^2 及 R^3 及 R^4 基的定義類似於式(IV)中所給定義(圖示 6)：

圖示 6



g) 根據下面反應圖示，式(IV-2)之噻吩羧酸類的反應，在一種式(XII)的有機疊氮化物及一種輔助的鹼存在下及在一種溶劑內進行，製得式(IV-3)之噻吩胺基甲酸酯類，其中 X^1 、 X^2 及 R^3 及 R^4 基的定義類似於那些在式(IV)中所給定義(圖示 7)：

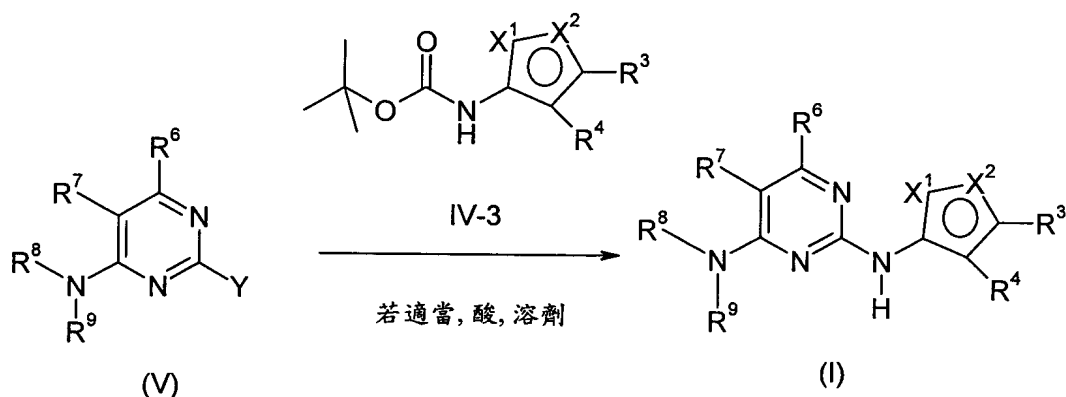
圖示 7



E=親電子基

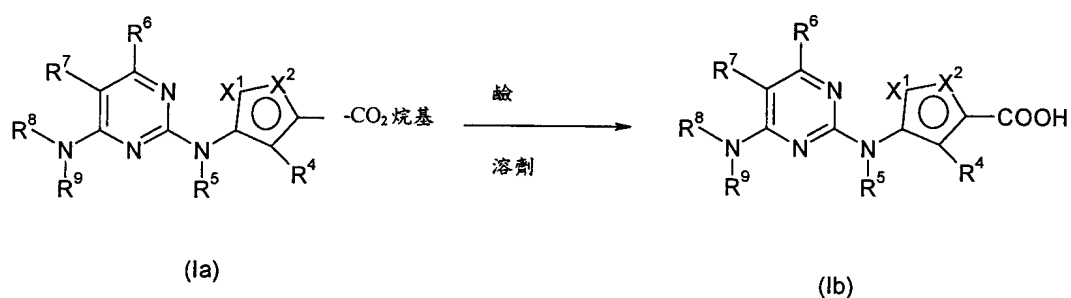
- h) 根據下面反應圖示，式(IV-3)的噻吩胺基甲酸酯類與式(V)的中間物之反應，適當的在一種酸存在下及一種溶劑內進行，製得式(I)之噻吩基胺基嘧啶，其中 X^1 、 X^2 及 R^3 及 R^4 基的定義類似於那些在式(IV)中所給定義(圖示 8):

圖示 8



- i) 式 Ia 的噻吩基胺基嘧啶之反應，在一種鹼存在下及一種溶劑內進行，製得式 Ib 之噻吩基胺基嘧啶(圖示 9)，其中 X^1 、 X^2 及 R^4 基之定義相同於式(IV)中之定義。製備式(Ia)的一種方法被顯示於圖示 2。

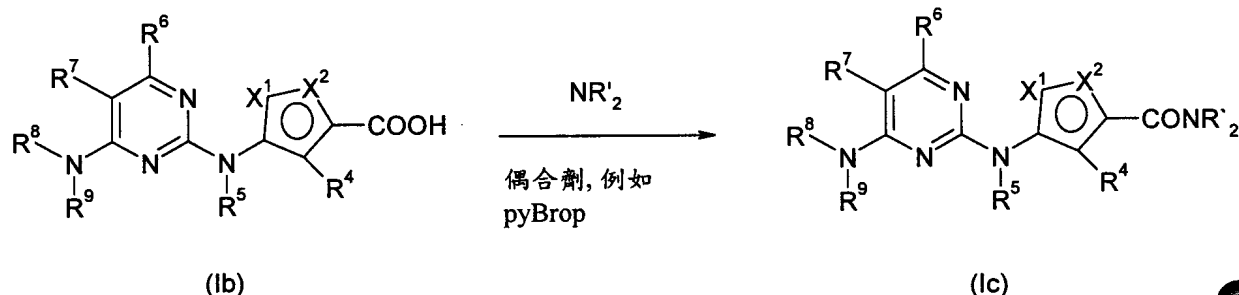
圖示 9



烷基=Me, Et, Pr

- j) 式(Ib)之噻吩基胺基嘧啶之反應，在一種偶合劑及一種輔助的鹼存在下及在一種溶劑內進行，製得式(Ic)之噻吩基胺基嘧啶，其中 X^1 、 X^2 及 R^4 基之定義相同於式(IV)中之定義(圖示 10)。

圖示 10



製備式(IV-1)的化合物之一種方法被出示於圖示 6 中。

經取代之胺基噻吩類(IV-1)可藉由例如，令購得的適當的經取代之硝基噻吩類(XI)與還原劑(例如鐵粉、鋅粉、錫粉，見，例如，*Heterocycles* **2005**, 65, 2369-2380)在一適當的溶劑，例如，乙酸或鹽酸內，於自 20°C 至 150°C 的溫度下，但較好於自 70°C 至 90°C 下反應而製得(圖示 6)。

製備式(IV-3)的化合物之一種方法被出示於圖示 7 中。

合成式(IV-3)的噻吩胺基甲酸酯類包括，令購得的噻吩羧酸類(IV-2, 圖示 7)與有機疊氮化物類(XII)，例如，磷鹽基疊氮化物，在一種適當的鹼(例如，三乙基胺、二異丙基胺)存在下，於一種適當的溶劑(例如，第三-丁醇、苯甲醇)內反應，製得相關的噻吩胺基甲酸酯類(IV-3)(見，例如，WO 2007/076423; *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2006**, 16, 5567-5571)。

由式(IV-3)的化合物製備式(I)的化合物之一種方式被出示於圖示 8。

在此，令式(V)的中間物，在布忍斯特酸類，例如，無水的鹽酸、樟腦磺酸或對-甲苯磺酸存在下，在一種適當的溶劑，例如，二噁烷、THF、DMSO、DME、2-甲氧基乙醇、正丁醇或乙腈內，在0°C-140°C的溫度下，與一種式(IV-3)的噻吩胺基甲酸酯進行反應1-48小時。

製備式(Ib)的化合物之一種方式被出示於圖示9。

於是，例如，由出示於圖示2的方法取得之式(Ia)類型之經烷氧基羰基取代的噻吩基胺基嘧啶可被轉換，適當的在一種酸存在下，於一種溶劑內進行，然後藉由與適當的鹼，例如，NaOH或KOH，在一種適當的溶劑，例如，水內進行水解，製得相關的經羧酸取代的噻吩基胺基嘧啶(Ib)(見，例如，*J. Med. Chem.* **1986**, 29, 1637-1643)。

製備式(Ic)的化合物之一種方法被出示於圖示10中。

令經羧酸取代的噻吩基胺基嘧啶(Ib)與胺類反應，使用一般已知的偶合劑(例如，溴化三吡咯啶基磷六氟磷酸鹽, PyBrop)，在一種輔助的鹼存在下及一種溶劑內進行，可能產生相關的經羧醯胺取代之噻吩基胺基嘧啶(Ic)(見，例如，WO 06/040569)。

製備式(IX)的化合物之一種方式被出示於圖表3中。

2-鹵基-經取代的嘧啶-4-酮類(VI)係藉由特定選擇的水解，得自2,4-二鹵基-取代的嘧啶，此被披露於，例如，*Russ. J. Org. Chem.* **2006**, 42, 580; *J. Med. Chem.* **1965**, 8, 253 中。

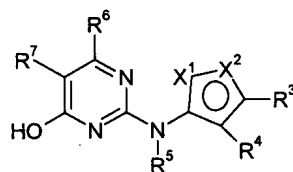
式(VI)的中間物，在布忍斯特酸類，例如，無水的氫氯酸、樟腦磺酸或對-甲苯磺酸存在下，在一種適當的溶劑，例如，二噁烷、THF、DMSO、DME、2-甲氧基乙醇、正丁醇或乙腈內，於0°C-140°C的溫度下，與一種噻吩胺(IV)進行反應1-48小時。

或者，(VI)與(IV)製得(IX)之反應也可以鹼催化進行，即，使用，例如碳酸鹽類，例如，碳酸鉀、醇化物類，例如，第三-丁氧化鉀氫化物類，例如，氫化鈉，也可使用過渡金屬，例如，鈀，一起與一種適當的配體，例如，xanthphos。

最後，(VI)與(IV)製得(IX)之反應也可能在無溶劑及/或布忍斯特酸類存在下進行(被披露於，例如，*Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2006**, 16, 108; *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2005**, 15, 3881 中)。

一些式(IX)的化合物類為新穎化合物並因此也為本發明的標的之一部分。

新穎的式(IX)化合物



(IX)

其中的符號具有如下之意義：

X^1 、 X^2 、 R^1 至 R^6 、 R^7 具有如上述所給之一般的、較佳的、特別佳的、極佳的以及尤其佳的意義。

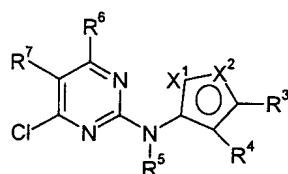
製備式(X)化合物之一種方式被出示於圖示 4 中。

式(IX)的中間物可依一種類似的方法，藉由與適當的鹵化劑，例如，硫醯氯、五氧化二磷或磷醯氯，或其一種混合物，適當地在一種適當的溶劑，例如，甲苯或乙醇存在下，及適當地在一種適當的鹼，例如，三乙基胺存在下進行被轉換，製得式(X)之2-噻吩胺基-4-氯嘧啶。此被披露於，例如，*J. Med. Chem.* **1989**, 32, 1667; *J. Heterocycl. Chem.* **1989**, 26, 313 中。

一些式(X)的化合物類為新穎化合物並因此也為本發明的標的之

一部分。

新穎的式 (X) 化合物



(X)

其中的符號被定義如下：

X¹、X²、R¹至 R⁷ 具有如上述所給之一般的、較佳的、特別佳的、極佳的以及尤其佳的意義。

製備式(I)的化合物之另一種方式被出示於圖示 5 中。

為製備式(I)之化合物，中間物(X)的反應係在一種鹼，例如碳酸鹽類，例如，碳酸鉀、烷氧化物類，例如，第三-丁氧化鉀、或氫化物類，例如氫化鈉存在下，在一種適當的溶劑，例如，二噁烷、THF、DMSO、DME、2-甲氧基乙醇、正丁醇或乙腈內，在0°C-140°C的溫度下，與式(II)的胺進行反應1-48小時，其中催化劑也可使用一種過渡金屬，例如，鈀，一起與一種適當的配體，例如，三苯基膦或xanthphos。

根據本發明用於製備式(I)的化合物之方法宜使用一或多種反應輔助劑進行。

適合的反應輔助劑為，適當的，習用的無機或有機鹼類或酸接受體類。這些宜包括鹼金屬與鹼土金屬之乙酸鹽類、醯胺化合物類、碳酸鹽類、碳酸氫鹽類、氫化物類、氫氧化物類及醇化物類，例如，乙酸鈉、乙酸鉀或乙酸鈣、醯胺化鋰、醯胺化鈉、醯胺化鉀或醯胺化鈣、碳酸鈉、碳酸鉀或碳酸鈣、碳酸氫鈉、碳酸氫鉀或碳酸氫鈣、氫化鋰、氫化鈉、氫化鉀或氫化鈣、氫氧化鋰、氫氧化鈉、氫氧化鉀或

氫氧化鈣、甲醇鈉、乙醇鈉、正-或異-丙醇鈉、正-、異-、第二-或第三-丁醇鈉、或甲醇鉀、乙醇鉀、正-或異-丙醇鉀、正-、異-、第二-或第三-丁醇鉀;另外也包括鹼性有機氮化合物類,例如,三甲基胺、三乙基胺、三丙基胺、三丁基胺、乙基二異丙基胺、N,N-二甲基環己基胺、二環己基胺、乙基二環己基胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基苯基胺、吡啶、2-甲基-、3-甲基-、4-甲基-、2,4-二甲基-、2,6-二甲基-、3,4-二甲基-及3,5-二甲基吡啶、5-乙基-2-甲基吡啶、4-二甲基胺基吡啶、N-甲基六氫吡啶、1,4-二氮雜雙環并[2.2.2]辛烷(DABCO)、1,5-二氮雜雙環并[4.3.0]壬-5-烯(DBN)或1,8-二氮雜雙環并[5.4.0]十一碳-7-烯(DBU)。

根據本發明之方法宜使用一或多種的稀釋劑進行。適合的稀釋劑實質地為所有的惰性有機溶劑。這些較佳地包括脂肪族及芳族的,選擇地鹵化的烴類,例如戊烷、己烷、庚烷、環己烷、石油醚、揮發油、石油英、苯、甲苯、二甲苯、二氯甲烷、氯化乙烯、氯仿、四氯化碳、氯苯及鄰-二氯苯、醚類,例如二乙醚及二丁基醚、甘醇二甲基醚及二甘醇二甲基醚、四氫呋喃及二噁烷、酮類,例如丙酮、甲基乙基酮、甲基異丙基酮或甲基異丁基酮、酯類,例如,乙酸甲酯或乙酸乙酯、腈類,例如,乙腈或丙腈、醯胺類,例如,二甲基甲醯胺、二甲基乙醯胺及N-甲基吡咯酮、以及二甲亞砷、四亞甲基砷及六甲基磷酸三醯胺及DMPU。

根據本發明之方法中,反應溫度可在相對廣的範圍間變化。通常,反應係在介於0°C與250°C間的溫度,較佳地為在介於10°C與185°C間的溫度下進行。

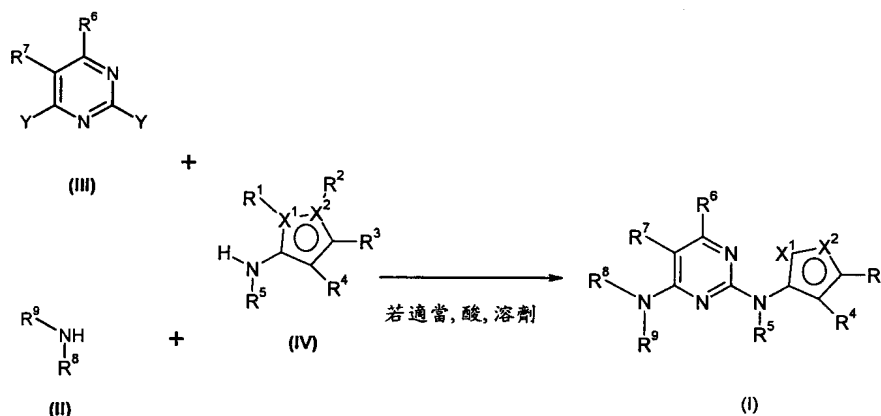
根據本發明之方法通常在大氣壓下進行。然而其也有可能在高

壓或減壓下進行。

進行根據本發明之方法時，各情況下所需要的起始材料通常以約等莫耳的量被應用，然而也有可能使用組分之一為相對地大量之情形。根據本發明之完工處理，在各情況下係依傳統方法進行(參考各製備實例)。

通常，式(I)的化合物之製備可為，例如，相繼地進行一種脂肪族胺(II)及雜芳族胺(IV)之親核性加成反應，製得一種適當的經取代的嘧啶(III)，如下面圖示9中所示：

圖示9



在此，Y，各情形下彼此獨立地，代表適當的釋離基，例如，一種鹵素原子(Hal = F、Cl、Br、I)、SMe、SO₂Me、SOMe或是三氟甲磺基(CF₃SO₂O: 用於嘧啶類, 得知自 WO 2005/095386)。

根據圖示8或其他方法合成式(I)之噻吩基胺基嘧啶已有許多不同的實例被披露於文獻中(也參見，例如，WO 2003/076437)。

本發明也提供根據本發明的噻吩基胺基嘧啶或其混合物在非醫學上的用途，用於控制不想要的微生物。

本發明也提供用於控制不想要的微生物之一種組成物，其包含至少一種根據本發明之噻吩基胺基嘧啶。

此外，本發明關於用於控制不想要的微生物之一種方法，特徵在於將根據本發明之噻吩基胺基嘧啶施加至微生物及/或其居住環境。

根據本發明之化合物具有強力之殺微生物的作用且可被使用供控制不想要的微生物，例如作物保護及材料保護方面之真菌及細菌。

根據本發明之式(I)的噻吩基胺基嘧啶具有極佳之殺真菌的性質且可被應用於作物保護上，例如，用於控制根腫菌(Plasmodiophoromycetes)、卵菌(Oomycetes)、壺菌(Chytridiomycetes)、接合菌(Zygomycetes)、子囊菌(Ascomycetes)、擔子菌(Basidiomycetes)及不完全菌類(Deuteromycetes)之微生物。

根據本發明之殺真菌的組成物可被使用供治療性及保護性控制植物病原性真菌，因此，本發明也關於使用根據本發明之活性化合物或組成物用於控制植物病原性真菌之治療的及保護的方法，係將其施用在種子、植物或植物部分、果實或植物成長的土壤上。

根據本發明在作物保護上用於控制植物病原性真菌之組成物包含一種有效的，但對植物無毒害之量的根據本發明之活性化合物。“有效的，但對植物無毒害之量”意指根據本發明之組成物的量為足以呈一種令人滿意的方式控制植物的真菌性疾或使之完全地消滅，且其在同時不會造成任何明顯的植物毒性徵狀。通常，施用率可在相當廣的範圍間變化，視多種因素而定，例如，欲被控制的真菌的種類、植物、氣候條件及根據本發明之組成成分的成分。

根據本發明，有可能處理所有的植物及植物的各部位，在此，可理解的，植物係指全部的植物及植物族群，例如，想要的與不想要的野生植物或作物植物(包括天然出現的作物植物)。作物植物為可被

種植、由傳統的育種與最適化方法或藉由生物科技的及基因遺傳法或由這些方法組合所取得者，包括轉殖基因植物及包括植物栽培品種，其為受到或未受到品種權益保護者。植物部分可理解的係指植物在地表上的與在地下部分的全部植物與器官，例如，幼芽、葉、花及根，可提及的實例為：葉子、針葉、莖、枝桿、花苞、果實體、水果以及種子，以及也包括根，球莖及根莖。植物部分也包括已收穫的材料及營養生長中的及繁殖用的材料，例如，插條、球莖、根莖、匍匐莖及種子。

下述植物為可被提及可根據本發明處理者：棉、亞麻、葡萄、水果、蔬菜，例如，薔薇科屬植物(*Rosaceae sp.*) (例如 梨果類，例如蘋果及梨，但也包括核果類，例如，杏子、櫻桃、杏仁及桃子以及漿果類，例如草莓)，*Ribesioideae sp.*，胡桃科(*Juglandaceae sp.*)，樺科(*Betulaceae sp.*)，漆樹科(*Anacardiaceae sp.*)，山毛櫸樹(*Fagaceae sp.*)，桑科(*Moraceae sp.*)，木犀科(*Oleaceae sp.*)，獼猴桃科(*Actinidaceae sp.*)，樟科(*Lauraceae sp.*)，芭蕉科(*Musaceae sp.*) (例如，香蕉樹及香蕉園)，茜草科(*Rubiaceae sp.*) (例如咖啡)，茶科(*Theaceae sp.*)，梧桐科(*Sterculiaceae sp.*)，芸香科(*Rutaceae sp.*) (例如，檸檬類、柑橘類及葡萄柚)，茄科(*Solanaceae sp.*) (例如，蕃茄)，百合科(*Liliaceae sp.*)，*Asteraceae sp.* (例如萬苣)，繖形科(*Umbelliferae sp.*)，十字花科(*Cruciferae sp. sp.*)，藜科(*Chenopodiaceae sp.*)，葫蘆科(*Cucurbitaceae sp.*)，蔥科(*Alliaceae sp.*) (例如韭菜、洋蔥)，*Papilionaceae sp.* (例如水梨)，主要的作物植物類，例如禾本科(*Gramineae sp.*) (例如玉米、草地、穀類，例如小麥、黑麥、水稻、大麥、燕麥、小米及黑小麥)，菊科屬植物(*Asteraceae sp.*) (例如，向

日葵)，甘藍菜科(*Brassicaceae sp.*) (例如白捲心菜、紅捲心菜、孢子甘藍、花椰菜、球芽甘藍、小白菜、撒藍、蘿蔔及油菜、芥菜、山葵及水芹)，豆科(*Fabaceae sp.*) (例如豌豆、花生)，蝶形花科(*Papilionaceae sp.*) (例如大豆)，茄科(*Solanaceae sp.*) (例如馬鈴薯)，藜科(*Chenopodiaceae sp.*) (例如甘蔗、飼料甜菜、牛皮菜、甜菜根)、作物植物及花園與林業中的觀賞植物、以及這些植物之基因改造的品種，較佳地，根據本發明被處理者為穀類作物。.

可根據本發明被處理之真菌疾病之一些病原菌，被順便舉例如下，但不限於：

造成白粉病之病原菌，例如，布氏白粉病菌屬(*Blumeria species*)之大麥粉狀黴菌病原體(*Blumeria graminis*); 單囊殼屬(*Podosphaera species*)之蘋果白粉病菌(*Podosphaera leucotricha*); 單絲殼屬(*Sphaerotheca species*)之紅豆白粉病菌(*Sphaerotheca fuliginea*); 鉤絲殼屬(*Uncinula species*)之葡萄鉤絲殼(*Uncinula necator*);

造成銹病之病原菌，例如，*Gymnosporangium species*之杜松梨鐵銹菌(*Gymnosporangium sabinae*); 咖啡銹病屬(*Hemileia species*)之駝孢銹病菌(*Hemileia vastatrix*); 銹菌病屬(*Phakopsora species*)之大豆銹病菌(*Phakopsora pachyrhizi*與*Phakopsora meibomia*); 銹菌病屬(*puccinia species*)之小麥赤銹病菌(*Puccinia recondita*)或小麥銹病菌(*Puccinia triticina*); 單孢銹菌病屬(*Uromyces species*)之疣頂單胞銹菌(*Uromyces appendiculatus*);

由卵菌綱病原菌造成之疾病，例如，盤梗霉屬(*Bremia species*)之萵苣盤梗霉(*Bremia lactucae*); 霜霉菌屬(*Peronospora species*)之豌豆霜霉(*Peronospora pisi*)或莖薹霜霉(*P. brassicae*);

疫病屬(*Phytophthora* species)之致病疫菌(*Phytophthora infestans*);
 露菌屬(*Plasmopara* species)之葡萄露菌(*Plasmopara viticola*); 假
 霜霉菌屬(*Plasmopara* species)之葎草假霜霉(*Pseudoperonospora*
humuli)或瓜類露菌(*Pseudoperonospora cubensis*); 腐霉菌屬
 (*Pythium* species)之終極腐霉菌(*Pythium ultimum*);

造成葉斑點病及葉枯萎病者，例如，鏈格孢菌屬(*Alternaria*
species)之早疫病鏈格孢菌(*Alternaria solani*); 褐斑病菌屬
 (Cercospora species)之甜菜褐斑病菌(*Cercospora beticola*); 星病菌
 屬(*Cladosporium* species)之黃瓜黑星病菌(*Cladosporium*
cucumerinum); 孢腔菌屬(*Cochliobolus* species)之禾旋孢腔菌
 (*Cochliobolus sativus*)(分生孢子型: Drechslera, syn: 長蠕孢); 炭
 疽菌屬(*Colletotrichum* species)之炭疽菌(*Colletotrichum*
lindemuthanum)者; Cycloconium 菌屬(*Cycloconium* species)之孔雀
 斑菌(*Cycloconium oleaginum*); 蒂腐病菌屬(*Diaporthe* species)之柑
 桔黑點病菌(*Diaporthe citri*); 柑桔瘡痂病菌屬(*Elsinoe* species)之柑
 桔瘡痂病菌(*Elsinoe fawcettii*); 炭疽菌屬(*Gloeosporium* species)之
 桃炭疽菌(*Gloeosporium laeticolor*); 晚腐菌屬(*Glomerella* species)
 之葡萄晚腐菌(*Glomerella cingulata*); 黑腐菌屬(*Guignardia* species)
 之葡萄黑腐菌(*Guignardia bidwelli*); 球腔菌屬(*Leptosphaeria*
species)之十字花科小球腔菌(*Leptosphaeria maculans*);
 Magnaporthe 菌屬(*Magnaporthe* species)之*Magnaporthe grisea*;
 Microdochium 菌屬(*Microdochium* species)之*Microdochium nivale*;
 蔓枯病菌屬(*Mycosphaerella* species)之*Mycosphaerelle graminicola*
 及*M. fijiensis*; 葉枯病菌屬(*Phaeosphaeria* species)之小麥穎枯菌

(*Phaeosphaeria nodorum*); 核腔菌屬(*Pyrenophora species*)之圓核腔菌病菌(*Pyrenophora teres*); 葉斑病菌屬(*Ramularia species*)之
Ramularia collo-cygni; 喙孢菌屬(*Rhynchosporium species*)之小麥雲紋病菌(*Rhynchosporium secalis*); 殼針孢屬(*Septoria species*)之斑枯菌(*Septoria apii*); 淡紅核瑚菌屬(*Typhula species*)之小麥雪腐菌(*Typhula incarnata*); 黑星菌屬(*Venturia species*)之蘋果黑星病菌(*Venturia inaequalis*);

造成根與莖的疾病者，例如，伏革菌屬(*Corticium species*)之
Corticium graminearum; 鐮刀菌屬(*Fusarium species*)之蘿蔔黃葉病菌(*Fusarium oxysporum*); 禾頂囊殼菌屬(*Gaeumannomyces species*)之小麥全蝕病菌(*Gaeumannomyces graminis*); 根腐病菌屬(*Rhizoctonia species*)之立枯絲核菌(*Rhizoctonia solani*);
Oculimacula(*Tapesia*)菌屬之*Tapesia acuformis*; 黑腐菌屬之煙草根黑腐菌(*Thielaviopsis basicola*);

造成穗與花序(包括玉米穗軸)之疾病者，例如，鏈格孢菌屬(*Alternaria*)之鏈格孢屬菌(*Alternaria spp.*); 麴黴屬(*Aspergillus species*)之黃麴菌(*Aspergillus flavus*); 星病菌屬(*Cladosporium species*)之水稻污點病菌(*Cladosporium cladosporioides*); 麥角菌屬(*Claviceps species*)之麥角病菌(*Claviceps purpurea*); 鐮孢菌屬(*Fusarium species*)之大刀鐮孢(*Fusarium culmorum*); 赤黴菌屬(*Gibberella species*)之玉蜀黍赤黴(*Gibberella zeae*); 雪黴菌屬(*Monographella species*)之小麥雪腐病菌(*Monographella nivalis*); 殼針孢屬(*Septoria species*)之小麥穎枯病菌(*Septoria nodorum*);

由黑穗真菌造成之疾病，例如，軸黑粉菌屬(*Sphacelotheca*

species)之絲軸黑粉菌(*Sphacelotheca reiliana*); 腥黑粉菌屬(*Tilletia* species)之小麥網腥黑粉菌(*Tilletia caries*)、*T. controversa*; 條黑粉菌屬(*Urocystis* species)之 *Urocystis occulta*; 黑穗菌屬(*Ustilago* species)之 *Ustilago nuda*; *U. nuda tritici*;

造成水果腐壞者，例如，麴黴屬(*Aspergillus* species)之黃麴菌(*Aspergillus flavus*); 灰黴菌屬屬(*Botrytis* species)之灰葡萄孢(*Botrytis cinerea*); 青黴菌屬(*Penicillium* species)之擴展青黴菌(*Penicillium expansum*)及紫變青黴(*P. purpurogenum*); 菌核菌屬(*Sclerotinia* species)之油菜菌核病菌(*Sclerotinia sclerotiorum*); 黃萎菌屬(*Verticilium* species)之黃萎輪枝黴(*Verticilium alboatrum*);

種子-及土壤-攜帶的腐壞及萎凋疾病類，及造成幼苗之疾病，例如，鐮孢菌屬(*Fusarium spec.*)之黃色鐮孢菌(*F. culmorum*); 疫病屬(*Phytophthora* species)之疫黴菌(*Phytophthora cactorum*); 腐霉菌屬(*Pythium* species)之終極腐霉(*Pythium ultimum*); 根腐菌屬(*Rhizoctonia* species)之立枯絲核菌(*Rhizoctonia solani*); 白絹菌屬(*Sclerotium* species)之白絹菌(*Sclerotium rolfsii*);

造成癌狀的疾病、蟲癭及不正常的叢狀枝芽者，例如，腐爛菌屬(*Nectria* species)之梨樹潰瘍菌(*Nectria galligena*);

造成枯萎疾病者，例如，褐腐菌屬(*Monilinia* species)之鏈核盤菌(*Monilinia laxa*);

造成葉、花及水果變形之疾病類者，例如，外囊菌屬病(*Taphrina* species)之畸形外囊菌(*Taphrina deformans*);

造成木質植物的退化性疾病，例如，艾斯卡屬(*Esca species*)之
*Phaemoniella clamydosporea*及*Phaeoacremonium aleophilum*及
Fomitiporia mediterranea;

造成花及種子的疾病類，例如，灰黴菌屬(*Botrytis species*)之灰
 葡萄孢(*Botrytis cinerea*);

造成植物球莖的疾病者，例如，根腐病屬(*Rhizoctonia species*)之
 立枯絲核菌(*Rhizoctonia solani*); 長蠕孢屬(*Helminthosporium species*)之
 茄長蠕孢(*Helminthosporium solani*);

細菌病原菌造成之疾病，例如，黃單胞桿菌屬(*Xanthomonas species*)之
 野菜黃單胞桿菌(*Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*); 假單胞
 菌屬(*Pseudomonas species*)之瓜類細菌性褐斑菌(*Pseudomonas syringae*
 pv. *lachrymans*); 軟腐菌屬(*Erwinia species*)之蘋果熱萎凋菌(*Erwinia amylovora*)。

較佳者係用於控制下類的大豆疾病:

在葉子、莖部、豆莢及種子上造成之真菌疾病者，例如，葉斑
 點病[鏈格菌屬(*Alternaria spec.*)、格孢菌屬(*atrans tenuissima*)]、炭疽
 病(*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*)、褐斑病
 (*Septoria glycines*)、葉斑與枯萎病(*Cercospora kikuchii*)、*Choanephora*
 葉枯萎病(*Choanephora infundibulifera trispora* (syn.))、*Dactuliophora*
 葉斑病(*Dactuliophora glycines*)、霜黴病(*Peronospora manshurica*)、
Drechslera 枯萎病(*Drechslera glycini*)、灰斑病(*Cercospora sojae*)、
Leptosphaerulina 葉斑病(*Leptosphaerulina trifolii*)、*Phyllosticta* 葉斑病
 (*Phyllosticta sojaecola*)、豆莢與莖萎凋病(*Phomopsis sojae*)、白粉病
 (*Microsphaera diffusa*)、*Pyrenochaeta* 葉斑病(*Pyrenochaeta glycines*)、

絲核菌屬的空中結球，簇葉，與網狀枯萎(*Rhizoctonia solani*)，銹病(*Phakopsora pachyrhizi*、*Phakopsora meiborniae*)、結痂病(*Sphaceloma glycines*)、黑腐病(*Stemphylium botryosum*)、高粱葉斑病(*Corynespora cassicola*)。

在根及莖基部造成的真菌的疾病，例如，黑根腐病(*Calonectria crotalariae*)、炭腐病(*Macrophomina phaseolina*)、鐮孢菌枯萎或萎凋，根腐，及豆莢與根頸腐病(*Fusarium oxysporum*、*Fusarium orthoceras*、*Fusarium semitectum*、*Fusarium equiseti*)、*Mycoleptodiscus* 根腐病(*Mycoleptodiscus terrestris*)、*Neocosmospora* (*Neocosmospora vasinfecta*)、豆莢與莖萎凋(*Diaporthe phaseolorum*)、莖腐(*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*)、*Phytophthora* 腐朽病(*Phytophthora megasperma*)、褐莖腐病(*Phialophora gregata*)、腐霉菌屬病(*Pythium aphanidermatum*、*Pythium irregulare*、*Pythium debaryanum*、*Pythium myriotylum*、*Pythium ultimum*)、*Rhizoctonia* 根腐，莖腐朽，以及猝倒病(立枯絲核菌)、莖菌核病(油菜菌核病菌，*Sclerotinia sclerotiorum*)、白絹病(白絹病菌，*Sclerotinia rolfii*)、*thielaviopsis* 根腐病(根串珠黴，*Thielaviopsis basicola*)。

本發明的情況中，不想要的微生物可理解的係指植物病原性真菌及細菌。於是，根據本發明的化合物可被應用供保護植物，在經處理後得以對抗造成上述疾病之病原菌達一段時間。此保護期間通常為植物被活性化合物處理後有效達 1 至 10 天，特別佳的為 1 至 7 天。

活性化合物在用於控制植物疾病所需的濃度可被植物耐受得極好之事實下，允許用於處理植物的地面上部分、營養期的繁殖材料及

種子、以及土壤。

此內文中，根據本發明的活性化合物特別有成效被應用於供控制穀物疾病，例如，對抗白粉病菌屬(*Erysiphe species*)、銹病菌屬及對抗鐮孢菌屬(*Fusaria species*)之病菌，控制水稻疾病，例如，對抗稻熱病(*Pyricularia*)及立枯絲核病(*Rhizoctonia*)之病菌以及在葡萄栽培、水果生產及蔬菜生產中之疾病，例如，對抗灰葡萄孢、黑星菌、白粉病菌(*Sphaerotheca*)及 *Podosphaera* 屬之病菌。

根據本發明的活性化合物也適於供增加產量，此外，它們對植物呈現一種低度之毒性，且被植物耐受得很好。

適當的，根據本發明的化合物，在某種濃度或施用率下，也可被使用作為殺草劑、安全劑、生長調節劑或用於改進植物性質之藥劑，或是作為殺微生物劑，例如作為殺真菌劑、抗黴劑、殺細菌劑、殺病毒劑(包括對抗類病毒劑)或作為對抗 MLO (類-黴漿菌之有機體)及 RLO (類-立克次氏體之有機體)。適當的，它們也可被應用作為殺昆蟲劑類。適當的，它們也可被應用作為合成其他活性化合物之中間物或前驅物。

適當的，根據本發明的活性化合物在某種濃度及施用率下也可被作為殺草劑及用於影響植物生長，也供控制動物有害生物。適當的，它們也可被應用作為合成其他活性化合物之中間物或前驅物。

根據本發明的活性化合物，在組合下，具有很好的植物耐受性與對溫血動物具有有利的毒性，且能讓環境忍受得很好，故適於供保護植物及植物器官、供增進收穫量、用於改進收穫材料之品質。它們較佳地被應用作為植物保護劑。它們具有活性對抗正常敏感的及具抗性的種類及對抗全部或一些發育階段。

根據本發明以活性化合物或組成物處理植物及植物部分，係藉由傳統的處理方法，直接地作用其本身或其周圍環境、居所或儲存空間，例如，藉由浸泡、噴灑、氣霧化、灌溉、蒸發、塵染、霧化、撒佈、泡沫、塗佈、分散、澆水(浸濕)、滴灌，用於處理繁殖材料，特別是種子的情況下，也被作成粉末供乾燥種子處理、作成溶液供種子處理、作成水-可溶的粉末供進行漿液處理、包殼、塗覆一或多層外套、等々方式。尚有可能藉由超低容量法施用活性化合物，或將活性化合物配製劑或活性化合物本身注射入土壤之方式。

活性化合物之施用率可在實質上極大的範圍間變化。基本上，視所要的效果本質而定。通常，施用率為對於每公頃的土壤施用介於1克與10公斤間的活性化合物，較佳為施用介於5克與5公斤/公頃的量。

根據本發明的化合物與作物植物之相容性的有利影響在某種濃度比例下特別地醒目。然而，在活性化合物組成物中之活性化合物之重量比例可在相當地廣的範圍間變化。通常為，自0.001至1000份重，較佳地為自0.01至100份重，特別佳的為自0.05至20份重的化合物之一，上述(b')項下所提的改善作物植物相容性(解藥/安全劑)之化合物為相當於每份重之式(I)之活性化合物。

根據本發明的活性化合物通常以完成的配製物型式被施用，然而，含在活性組合物內之活性化合物，可以為個別的配製物，也可以為在使用時被混合者，即，呈筒裝混合物之型式被施用。

此外，根據本發明之處理可能減少已收穫的材料及由其製備之食品及飼料中之黴菌毒素的含量。特別的，但非完全地代表者為，例如產生下述的黴菌毒素類：去氧雪腐鐮刀菌烯醇(deoxynivalenol,

DON)、雪腐鏟刀菌烯醇(nivalenol)、15-Ac-DON、3-Ac-DON、T2-及HT2-毒素類、腐馬素毒素(fumonisin)、玉米烯酮毒素(zearalenone)、串珠鏟刀菌素(moniliformine)、鏟菌素(fusarin)、二乙酰蔗草鏟刀烯醇毒素(diacetoxyscirpenol, DAS)、白殭菌素(beauvericin)、恩鏟孢菌素(enniatin)、fusaroproliferin、fusarenol、赭麴毒素(ochratoxins)、棒曲霉素(patulin)、麥角生物鹼類(ergot alkaloids)及黃麴毒素(aflatoxins)，由下類真菌產生：鏟孢菌(*Fusarium spec.*)，例如，銳頂鏟孢菌(*Fusarium acuminatum*)、*F. avenaceum*、*F. crookwellense*、黃色鏟孢菌(*F. culmorum*)、禾穀鏟孢菌(*F. graminearum*, *Gibberella zeae*)、木賊鏟孢菌(*F. equiseti*)、*F. fujikuroi*、*F. musarum*、尖孢鏟孢菌(*F. oxysporum*)、蕙蘭細斑病菌(*F. proliferatum*)、*F. poae*、*F. pseudograminearum*、接骨木鏟孢菌(*F. sambucinum*)、藤草鏟孢菌(*F. scirpi*)、半裸鏟孢菌(*F. semitectum*)、茄病鏟孢菌(*F. solani*)、擬枝孢鏟孢菌(*F. sporotrichoides*)、*F. langsethiae*、膠孢鏟孢菌(*F. subglutinans*)、三線鏟孢菌(*F. tricinctum*)、輪狀鏟孢菌(*F. verticillioides*)以及麴屬(*Aspergillus spec.*)、青黴屬(*Penicillium spec.*)、麥角菌(*Claviceps purpurea*)、穗黴菌屬(*Stachybotrys spec.*)，等等。

在材料保護方面，根據本發明的組成物或活性化合物可再被應用供保護工業材料以對抗不想要的微生物，例如真菌之攻擊及摧毀。

本文中，可理解的，所謂的工業材料是指已被製備供工藝技術中應用之無生命之材料，例如，欲藉由本發明的活性化合物保護以對抗微生物的改造或摧毀之工業材料可以是：粘著劑類、漿糊類、紙類與卡紙、織品、皮革、木料、塗料及模塑物件、冷卻的潤滑劑類及可被微生物攻擊或摧毀之其他材料、生產工場之零件，例如，可能受微

生物之增殖而造成不利影響之冷卻-水循環也。昆蟲是可被提及之被保護的材料。本發明的目的中，可提及之較佳的工業材料為：粘著劑類、漿糊類、紙類與卡紙、皮革、木料、塗料、冷卻的潤滑劑類及熱交換液體類，特別佳者為木頭。根據本發明之組成物或活性化合物可防止像是腐壞、腐朽、褪色、脫色或長黴之不利的影响。

根據本發明用於控制不想要的真菌之方法也可被應用供保護儲存的貨物。在此，可理解的，儲存的貨物係指需要長期保護的植物性或動物性天然物質或彼等之加工產物。植物性的儲存貨物為，例如，植物或植物部分，例如，莖、葉子、球莖、種子、水果、穀粒，可以是新鮮被採收的狀態或已被加工的型態(例如，預乾燥的、弄濕的、粉碎的、研磨的、壓製的或烘烤過的)，儲存的貨物也包括木材，不管是未經加工者，例如，建築木料、電線桿及柵欄，或是已完成的物件，例如，傢俱。動物性儲存的貨物為，例如，皮、皮革、毛皮及毛髮。根據本發明的活性化合物可防止不利的影響，例如，腐壞、腐朽、褪色、脫色或長黴。

可被提及之能降解或改變工業材料的微生物為，例如，細菌、真菌、酵母、藻類及粘液有機體。根據本發明的活性化合物的作用，適宜於對抗真菌，特別是黴菌、令木材變色及摧毀木材之真菌(擔子菌)及對抗粘液有機體及藻類。可被舉例者為下述屬之微生物：鏈格菌，例如，文錯黴菌(*Alternaria tenuis*); 麴黴菌，例如 *Aspergillus niger*; 毛殼菌類，例如球毛殼菌(*Chaetomium globosum*); *Coniophora*，例如粉孢革菌(*Coniophora puetana*); 革耳類(*Lentinus*)，例如虎皮香菇(*Lentinus tigrinus*); 青黴菌，例如 *Penicillium glaucum*; 多孔菌(*Polyporus*)，例如靈芝(*Polyporus versicolor*); *Aureobasidium*，例如黑

酵母(*Aureobasidium pullulans*); *Sclerophoma*，例如 *Sclerophoma pityophila*; *Trichoderma*，例如木黴菌(*Trichoderma viride*); 艾希氏菌(*Escherichia*)，例如大腸桿菌; 假單胞菌，例如綠膿桿菌(*Pseudomonas aeruginosa*); 葡萄球菌，例如金黃色葡萄球菌(*Staphylococcus aureus*)。

本發明也關於用於控制不想要的微生物的一種組成物，包含至少一種根據本發明之噻吩基胺基嘧啶。這些較佳地為適用在農業上之包含輔助劑、溶劑、載劑、界面活性劑或展延劑之殺真菌的組成物。

根據本發明，載劑係指一種天然的或合成的、有機的或無機的物质，活性化合物被混合或被結合在其中，以便達到更佳的施用性，特別是供施用至植物或植物部位或種子。此載劑可能為固體或液體，通常為惰性的且應適於供農業上使用。

適當的固體載劑為：例如，銨鹽類及研磨過的天然的材料，例如，高嶺土、粘土、滑石、白堊土、石英、美國活性白土、蒙脫土或矽藻土，以及研磨過的合成材料，例如，高度分散的二氧化矽、氧化鋁及矽酸鹽類；用於製備顆粒之適當的固態載劑為：例如，碾碎並分割過的天然岩石，例如，方解石、大理石、輕石、海泡石與白雲石，且也包括無機與有機碎料之合成顆粒，及有機材料顆粒，例如，紙、鋸屑、椰子殼、玉米穗軸與菸草莖；適當的乳化劑及/或泡沫-形成劑為：例如，非離子及陰離子性乳化劑類，例如，聚氧乙烯脂肪酸酯類、聚氧乙烯脂肪族醇醚類，例如 烷基芳基聚甘醇醚類、烷基磺酸鹽類、烷基硫酸鹽類、芳基磺酸鹽類以及蛋白質水解液類；適當的分散劑為非離子及/或離子性物質類，例如來自下類之醇/POE 及/或 POP 醚類、酸及/或 POP 或 POE 酯類、烷基芳基及/或 POP/POE 醚類、脂肪

及/或 POP/POE 加合物類，POE 及/或 POP 多羥基衍生物類、POE 及/或 POP 山梨醇酐或糖加合物類、烷基或芳基之硫酸酯類、磺酸酯類及磷酸鹽類或相關之 PO 醚加合物類。此外，包括適當的寡聚或多聚合物，例如，那些衍生自乙烯性單體、衍生自丙烯酸、衍生自 EO 及/或 PO 本身或組合者，例如，(聚)醇類或(聚)胺類。也有可能使用木質素及其磺酸衍生物類、無修飾的及經修飾的纖維素類、芳族的及/或脂肪族的磺酸類及其與甲醛的加合物類。

● 活性化合物可被配製成習用的配製物，例如，溶液類、乳液類、可濕性粉劑、水-或油-基的懸浮液、粉劑、塵劑、膏劑、可溶性粉劑、可溶性粒劑、供撒播的粒劑、懸浮液-乳液濃縮物、浸漬了活性化合物之天然的材料、浸漬了活性化合物之合成的材料、以及包覆於聚合性材料內之微膠囊。

● 根據本發明的活性化合物可以本身、其配製劑或由配製劑配製成之使用型式被使用，例如，即用溶液、乳液、水-或油-基的懸浮液、粉劑、可濕性粉劑、膏劑、可溶性粉劑、塵劑、可溶性粒劑、供撒播的粒劑、懸浮液-乳液濃縮物、浸漬了活性化合物之天然的材料、浸漬了活性化合物之合成的材料、肥料以及包覆於聚合性材料內之微膠囊。施用係以一種傳統的方式進行，例如藉由傾倒、噴灑、霧化、撒佈、塵染、泡沫、塗上、等等方式。也有可能藉由超低容量法或注射活性化合物的製劑或活性化合物本身至土壤內以施用活性化合物。也有可能處理植物的種子。

這些配製劑可以一種已知的方式製備，例如，將活性化合物與至少一種習用的展延劑、溶劑或稀釋劑、乳化劑、分散劑及/或粘結劑或固定劑、潤濕劑、潑水劑、適當的乾燥劑及 UV 安定劑以及適當

的著色劑及色素、抑泡劑、防腐劑、二級增稠劑、粘著物、激勃素(gibberellins)以及其他的加工輔助劑混合。

根據本發明的組成物不僅包括即可使用之配製劑，且也包括可使用一種適當的裝置施加至植物或種子上者，以及在使用前需以水稀釋之可購得的濃縮物。

根據本發明的活性化合物可以本身型式或其(購得的)配製劑型式或由這些配製劑與其他(已知的)活性化合物(例如殺昆蟲劑、引誘劑、不孕劑、殺細菌劑、殺蟎劑、殺線蟲劑、殺真菌劑、生長調節劑、殺草劑、肥料、安全劑及/或化學傳訊物質)配製成之使用型式存在。

適當的作為輔助劑使用者為，適於供摻入至組成物本身及/或由組成物衍生之配製劑(例如噴灑液、種子敷料)內的物質。特別的性質，例如某些技術的性質及/或特別的生物特質。典型的適當的輔助劑為：展延劑類、溶劑類及載劑類。

適當的展延劑為，例如，水、極性及非極性有機化學液體類，例如來自芳族及非-芳族的碳氫化合物類(例如，烯烴類、烷基苯類、烷基萘類、氯苯類)、醇類及多醇類(適當的，其也可為經取代的、醚化及/或酯化的)、酮類(例如，丙酮、環己酮)、酯類(包括脂肪及油類)及(聚)醚類、無取代的及經取代的胺類、醯胺類、內醯胺類(例如，*N*-烷基吡咯酮類)以及內酯類、礬類及亞礬類(例如，二甲亞礬)。

液化的氣體展延劑類或載劑係指那些在常溫常壓下原為氣體之液體類，例如，氣溶液噴射劑類，例如，鹵化的烴類，以及丁烷、丙烷、氯氣及二氧化碳。

粘結劑類，例如羧甲基纖維素及呈粉狀、粒狀及乳膠狀之天然的及合成的聚合物類，例如，阿拉伯膠、聚乙烯醇、聚乙烯醋酸酯、

或是天然的磷脂質類，例如，腦磷脂與卵磷酯脂及合成的磷脂質類可被使用於配方中。其他可能的添加物為礦物油及植物油類。

如果所使用的展延劑為水，也有可能使用，例如，有機溶劑作為輔助的溶劑類。適當的液態溶劑類主要為：芳族化合物類，例如，二甲苯、甲苯或烷基苯類、氯化的芳族化合物類或氯化的脂肪族烴類，例如，氯苯類、氯乙烯類或二氯甲烷、脂肪族烴類，例如，環己烷或石蠟類，例如，礦物油分劃物類、醇類，例如，丁醇或甘醇以及其醚類及酯類、酮類，例如，丙酮，甲基乙基酮，甲基異丁基酮或環己酮、強極性溶劑類，例如二甲基甲醯胺及二甲亞砷、以及水。

根據本發明的組成物也可再包含另外的組分，例如，界面活性劑類，適當的界面活性劑為具有離子或非離子性質之乳化劑及/或泡沫-形成劑、分散劑或潤濕劑或這些界面活性劑之混合物。其實例為：聚丙烯酸的鹽類、木質素磺酸之鹽類、苯酚磺酸或萘磺酸之鹽類、氧化乙烯與脂肪醇類或與脂肪酸類或與脂肪胺類之聚縮合物、經取代的苯酚類(宜為烷基酚類或芳基酚類)、磺基琥珀酸酯類之鹽類、牛磺酸衍生物類(特別是烷基牛磺酸酯類)、聚氧乙烯化醇類或酚類之磷酸酯類、多醇類之脂肪酸酯類、以及含硫酸酯、磺酸酯及磷酸酯官能基之本發明的化合物之衍生物類，例如，烷基芳基聚甘醇醚類、烷基磺酸酯類、烷基硫酸酯類、芳基磺酸酯類、蛋白質水解產物、木質素亞硫酸廢液及甲基纖維素。當活性化合物及/或惰性支撐物之一為水-不溶的且施用係於水中進行時，界面活性劑之存在是有必要的。界面活性劑的含量可為相當於根據本發明的組成物重量之自 5%至 40%間。

有可能使用著色劑，例如無機的色素類，例如，氧化鐵、二氧化鈦及普魯士藍，以及有機染料類，例如，茜素染料類、偶氮類染料

及金屬酞花青染料，以及微量營養成分，例如，鐵、錳、硼、銅、鈷、鉬及鋅等的鹽類。

其他可能被使用的添加物為香水、適當的經修飾的礦物或植物油類、蠟質及營養素(包括微量營養素)，例如，鐵、錳、硼、銅、鈷、鉬及鋅的鹽類、安定劑類，例如，低溫-穩定劑類、防腐劑類、抗氧化物類、光穩定劑類或其他的用於改善化學的及/或物理的安定性之物質類。

適當的，也可能存在其他的添加物組分，例如保護的膠體、粘結劑、膠合物、增稠劑、觸變劑、滲透劑、安定劑、螯合劑、複合物形成劑。通常活性化合物可與習用於配方中之任一種固體或液體併用。

配製物通常包含介於 0.05 與 99%重量計間、0.01 與 98%重量計間、較佳的為介於 0.1 與 95%重量計間、特別佳的為介於 0.5 與 90%重量計間、極佳的為介於 10 與 70%重量計間的活性化合物。

被描述如上面之配製物類可被應用於根據本發明的用於控制不想要的微生物的方法中，其中根據本發明之噻吩基胺基嘧啶被施用在微生物上及/或其生活環境。

根據本發明的活性化合物，可使用本身或其配製劑，也可使用其與已知的殺真菌劑、殺細菌劑、殺蟎劑、殺線蟲劑或殺昆蟲劑所成之混合物，用於增廣活性譜或預防發展出抗性。

適當的混合的夥伴為，例如，已知的殺真菌劑、殺昆蟲劑、殺蟎劑、殺線蟲劑或是殺細菌劑(也參考 Pesticide Manual, 13th ed.)。

也有可能使用與其他已知的活性化合物之混合物，例如使用與殺草劑類、或與肥料及生長調節劑類、安全劑類及/或化學傳訊物質

之混合物。

施用係以適於使用型式的方式進行。

病原性有害真菌之控制特別是藉由作物保護組成分處理土壤及植物地表上之部分。由於考慮作物保護組成物對環境及人類及動物健康上之衝擊，有待努力減少活性化合物之施用量。

活性化合物的被施用，可呈原本型態、其配製劑及由其配製之使用型態，例如即用溶液、懸浮液、可濕性粉劑、膏劑、可溶性粉末、塵劑及粒劑。施用係以習用的方式進行，例如，藉由澆水、噴灑、霧化、撒佈、塵染、泡沫、塗抹、等等。也有可能使用超低容量法或注射活性化合物本身至土壤內之方式。也可能處理植物之種子。

當使用根據本發明的化合物作為殺真菌劑時，施用率可在相對上廣範圍間變化，視施用的類型而定。根據本發明的活性化合物之施用率為：

- 處理植物之部位時，例如葉子：自 0.1 至 10 000 克/公頃，較佳的為自 10 至 1000 克/公頃，特別佳的為自 50 至 300 克/公頃(當施用係藉由澆水或浸泡方式時，其有可能降低施用率至更低，特別是當使用的惰性物質為岩棉或珍珠石時)；
- 處理種子時：自 2 至 200 克/100 公斤種子，較佳地為介於 3 至 150 克/100 公斤種子，特別佳者為自 2.5 至 25 克/100 公斤種子，極佳者為自 2.5 至 12.5 克/100 公斤種子；
- 處理土壤時：自 0.1 至 10 000 克/公頃，較佳地自 1 至 5000 克/公頃。

所提的這些施用率僅為一種示範例且非用於限制本發明。

根據本發明的化合物也可被使用供保護將與海水或有鹽味的水

接觸之物體，例如，船身，圍屏，網子，建築物，繫船用具及信號系統，用於對抗附著物之污滿。

根據本發明的化合物，單獨的或併用其他的活性化合物下，也可被應用作為防污劑。

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

視植物的品種或植物栽培品種，其分佈與生長條件(土壤、氣候、營養生長期間、營養狀態)，根據本發明的處理也可導致超加成的("協乘的")效果，於是，例如，減少的施用率及/或增廣的活性譜及/或增加可根據本發明被使用的活性化合物及組成物的活性、較佳的植物生長、增加耐受性於高溫或低溫、更耐乾旱或耐水或耐土壤鹽含量、增加的開花期、更容易的收割、加速的成熟、更高的收穫量、較大的果實、較高的植物、更綠的葉子、較早開花、收穫物之更佳的品質及/或具較高的營養價值、更甜的果實、收穫品的更佳儲存安定性及/或加工性，均可能超出實際被預期的效果。

在本案例下，不想要的植物病原性真菌及/或微生物及/或病毒，可理解的係指植物病原性真菌、細菌及病毒。於是，根據本發明之物質可被應用於供保護植物以對抗上述病原菌之攻擊達一段期間，經本發明之物質處理後，可保護的有效期間通常可達 1 至 10 天，較佳的為經活性物質處理植物後 1 至 7 天。

根據本發明適宜被處理之植物及植物栽培品種包括已放置了特別有利的基因材料之所有植物(不管是藉由育種及/或生物科技達成者均成)。

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

根據本發明也可被處理的植物及植物栽培品種為那些具有抗性對抗一或多種非生物逆境的植物，非生物逆境條件可能包括，例如，乾旱、曝露於低溫、熱曝露、滲透的壓力、溢流、增加的土壤鹽度、增加的礦物質曝露、臭氧曝露、高光照、氮營養素不足、磷營養素不足、樹蔭遮蔽。

根據本發明也可被處理的植物及植物栽培品種，為那些具下述特徵之植物：提升的收量特性、可導致所述植物之增加產量，例如，改善的植物生理、生長及發育，像是，水利用效率、水滯留效率、增加的氮使用、增加的碳吸收、增進的光合作用、增加的發芽效率及加速的成熟。收量可再藉由改善的植物結構(在逆境及非-逆境條件下)被影響，包括，提早開花、開花控制以便雜交種子生產、幼苗茁壯、植物體型大小、節間數目及距離、根生長、種子大小、果實大小、豆莢

大小、豆莢或穗的數目、每個豆莢或穗內種子的數目、種子質量、增加種子飽滿度、減少的種子消散、減少的豆莢裂開及抗倒伏性。另外的收量特色包括種子組成，例如，碳水化合物含量、蛋白質含量、油含量及組成、營養價值、減少抗營養的化合物、改善的加工性狀及較佳的儲存安定性。

根據本發明可被處理之植物為已表現雜種優勢的特性或雜交效果之雜交的植物，其通常表現較高的收量、較有活力、較健康及對生物及非生物的逆境因子具有抗性。這樣的植物典型地係由一種先天雄性-不育的親系(母系)與另種先天雄性-可育的親系(父系)經由雜交所得，雜交的種子典型地收穫自雄性-不育的植物並被販賣給農夫，雄性-不育的植物有時候(例如，在玉米之情況)可由除去穗狀雄花(即，機械摘除雄性繁殖器官或雄花)達成，但更典型地，雄不稔性係由植物基因組內之遺傳決定因素所導致，在那樣的情況，且尤其是當種子為自雜交的植物收穫的所要產物時，其為典型的有用於確保持含有雄性不稔性遺傳決定因子之雜交植物中之雄性可育性，得以被完全地保留之方法。此可藉由確保雄性親系具有適當的可育性恢復基因，其能恢復含基因決定因子之雜交植物內的雄性可育性，雄性不育的遺傳決定因素可能位於細胞質中，細胞質的雄性不育性(CMS)之實例，被披露於，例如，蕓薹屬(*Brassica species*)的植物中。然而，雄性不育的遺傳決定因素也可能位於核的基因組內。雄性不育植物也可藉由植物生物技術方法取得，例如，基因工程法。取得雄性-不育的植物之特別有用的方法被揭露於 WO 89/10396，其中，例如，一種核糖核酸酶，例如，barnase，被選擇地表現於雄蕊之絨毛細胞中，藉由表現在絨毛細胞內之一種核糖核酸酶抑制劑，例如，barstar，可恢復植物的生殖

力。

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

耐殺草劑的植物為，例如耐嘉磷塞的，即，被做成耐殺草劑嘉磷塞(glyphosate)或其鹽類之植物，例如，耐嘉磷塞的植物可得自藉由基因編碼 5-烯醇丙酮醯基莽草酸-3-磷酸酯合成酶(EPSPS)之酵素將植物轉化者，這類 EPSPS 基因之實例為沙門氏菌(*Salmonella typhimurium*)之 AroA 基因(突變種 CT7)、*Agrobacterium sp.*細菌之 CP4 基因、編碼一種矮牽牛(*petunia*)EPSPS 之基因、一種蕃茄的 EPSPS、或一種牛筋草(*Eleusine*)EPSPS，也可以是一種變異的 EPSPS。耐受嘉磷塞的植物也可為帶有可表現編譯嘉磷塞氧化還原酶之酵素的基因者，耐受嘉磷塞的植物也可得自表現編譯嘉磷塞乙醯基轉移酶之酵素的一種基因，耐受嘉磷塞的植物也可挑選自含上述基因之天然出現的突變種植物。

其他的耐受殺草劑之植物為，例如，被做成耐受用於抑制麩胺醯胺合成酶的殺草劑者，例如，畢拉草(bialaphos)、固殺草(phosphinothricin 或 glufosinate)。這類植物可得自：藉由表現去除殺草劑毒性的一種酵素或可耐受抑制作用之穀胺醯胺合成酶之變異株。這種有效的去毒性之酵素之一種為，例如，編碼一種固殺草乙醯基轉移酶的一種酵素(例如，得自鏈黴菌屬之 bar 或 pat 蛋白質)。表現一種外源的固殺草乙醯基轉移酶的植物已被披露。

其他的耐殺草劑的植物也為被做成可耐受殺草劑抑制的羥苯基

丙酮酸鹽二氧化酶(HPPD)者，羥苯基丙酮酸鹽二氧化酶係一種用於催化對-羥基苯基丙酮酸(HPP)轉形成黑尿酸鹽的反應之酵素，耐受HPPD抑制劑類之植物可以一種基因編碼天然地出現的抗性HPPD酵素之基因，或以一種編碼一種突變的HPPD酵素之基因被轉化。對HPPD-抑制劑的耐受性也可得自，以基因編譯某種能形成黑尿酸鹽之轉化的植物而不管藉由HPPD抑制劑之天然的HPPD酵素的抑制作用。植物對HPPD抑制劑類之耐受性，除了編譯耐受HPPD的酵素之一種基因外，也可藉由具有編譯前苯酸脫氫酶(prephenate dehydrogenase)酵素的一種基因轉化植物而改善。

又另類耐殺草劑之植物係被做成可耐受乙醯乳酸合成酶(ALS)抑制劑類之植物，已知的ALS抑制劑類包括，例如，磺醯基脲、咪唑啉酮(imidazolinone)、三唑并嘧啶類、嘧啶基氧(硫)苯甲酸酯類及/或磺醯基胺基羧基三唑啉酮殺草劑類。在ALS酵素內之不同的突變(也稱之為乙醯羧基酸合成酶, AHAS)也為已知的耐不同類殺草劑者。耐磺醯基尿素的植物及耐咪唑啉酮的植物之產生已被披露於國際刊物WO 96/033270。此外，耐磺醯基尿素-及耐咪唑啉酮-的植物已被披露於，例如，WO 07/024782 中。

耐咪唑啉酮及/或磺醯基尿素之其他的植物可由誘發的突變、在殺草劑存在下於細胞培養物中進行選擇或藉由突變育種取得。

也可根據本發明被處理之植物或植物栽培品種(得自植物生物技術方法，例如，基因工程法者)為：耐受-昆蟲的轉殖基因植物，即，被作成可耐受某種標靶昆蟲攻擊之植物。這樣的植物可得自基因轉化、或藉由選擇含有摻入這類昆蟲抗性的植物。

所謂"昆蟲-抗性的轉殖基因的植物"，在此係指任一種植物，其含有至少一個包含可編譯下述物質之編碼序列者：

- 1) 得自蘇力桿菌(*Bacillus thuringiensis*)之一種殺昆蟲的晶體蛋白質或其一種殺昆蟲的部分，例如，被列於下述線上位址之殺昆蟲的晶體蛋白質：
http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/,或其殺昆蟲的部分，例如，Cry 蛋白質類之蛋白質: Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry2Ab、Cry3Ae 或 Cry3Bb 或其殺昆蟲的部分; 或
- 2) 第二種得自蘇力桿菌之其他晶體蛋白質或其一部分存在下具殺昆蟲性質之來自蘇力桿菌之一種晶體蛋白質或其一部分，例如，由 Cry34 與 Cry35 晶體蛋白質組成之二元的毒素; 或
- 3) 一種雜種的殺昆蟲的蛋白質，包含來自蘇力桿菌之兩種不同的殺昆蟲的晶體蛋白質的部分，例如，上述 1)之蛋白質之一種混種或上述 2)之蛋白質之一種混種，例如，由玉米品項 MON98034 (產生之 Cry1A.105 蛋白質 WO 07/027777); 或
- 4) 上述 1) 至 3) 中任一項的蛋白質，其中一些，特別是 1 至 10 個胺基酸，被取代成另外的胺基酸以得到較高的殺昆蟲的活性去作用標靶種類之昆蟲，及/或擴展受影響的標靶昆蟲種類範圍。及/或在選殖或轉化期間，誘導編碼的 DNA 中之改變，例如，玉米品項 MON863 或 MON88017 內之 Cry3Bb1 蛋白質，或玉米品項 MIR604 內之 Cry3A 蛋白質;
- 5) 來自蘇力桿菌或仙人掌桿菌(*Bacillus cereus*)之一種殺昆蟲的分泌的蛋白質，或其一種殺昆蟲的一部分，例如，營養期殺蟲蛋白 (VIP)，網址位於：

http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html,
例如來 VIP3Aa 蛋白質類之蛋白質; 或

- 6) 在第二種來自蘇力桿菌或仙人掌桿菌之一種第二鵠分泌的蛋白質存在下之來自蘇力桿菌或仙人掌桿菌之具有殺昆蟲性質的分泌的蛋白質，例如，由 VIP1A 及 VIP2A 蛋白質組成的二元的毒素;
- 7) 一種混種的殺昆蟲的蛋白質，包含來自蘇力桿菌或仙人掌桿菌之不同的分泌的蛋白質的部分，例如，上述 1) 中之蛋白質之一種混種或上述 2) 中之蛋白質之一種混種; 或
- 8) 上述 1) 至 3) 中任一項的蛋白質，其中一些，特別是 1 至 10 個胺基酸，被取代成另外的胺基酸以得到較高的殺昆蟲的活性去作用標靶種類之昆蟲，及/或擴展受影響的標靶昆蟲種類範圍。及/或在選殖或轉化期間(仍編譯一種殺昆蟲的蛋白質)，誘導編碼的 DNA 中之改變，例如，棉花品項 COT102 內之 VIP3Aa 蛋白質。

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

也可根據本發明被處理之植物或植物栽培品種(得自植物生物技術方法，例如，基因工程法者)為耐受非生物逆境因素之植物，這類

植物可藉由基因轉化、或藉由挑選含有突變因子於這類逆境抗性的植物，特別有用的耐受逆境之植物包括：

- a. 含有在植物細胞或植物中能減少聚(ADP-核糖)聚合酶(PARP)基因的表現及/或活性之一種轉殖基因的植物；
- b. 含有能減少植物或植物細胞的 PARC 編碼基因的表現及/或活性之一種提升逆境耐受性的轉殖基因之植物；
- c. 含有一種提升逆境耐受性的轉殖基因供編譯菸鹼醯胺腺嘌呤二核苷酸補救生合成路徑的一種植物-功能的酵素之植物，包括菸鹼醯胺酶、菸鹼酸磷酸核糖轉移酶、菸鹼酸單核苷酸腺嘌呤基轉移酶、菸鹼醯胺腺嘌呤二核苷酸合成酶或菸鹼醯胺磷酸核糖基轉移酶。

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

- 1) 合成一種經修飾的澱粉之轉殖基因植物，其中澱粉之物理-化學特性，特別是直鏈澱粉含量或直鏈澱粉/支鏈澱粉的比例、分枝的程度、平均鏈長、側鏈分佈、粘性性狀、膠凝強度、澱粉顆粒大小及/或澱粉顆粒之形態，與原始型植物細胞或植物中被合成的澱粉相比較，已被改變，使得此經修飾的澱粉更適於供特殊的應用；
- 2) 合成非-澱粉的碳水化合物聚合物或合成帶有具改變性狀的(與未經基因改造的野生型態的植物相比較而言)之非-澱粉碳水化合物聚合物之轉殖基因植物，實例為，產生聚果糖之植物，尤其是菊糖(inulin)與果聚糖(levan)類型、產生 α -1,4-葡聚糖之植

物、產生 alpha-1,6 分枝的 alpha-1,4-葡聚糖之植物、以及產生 alternan(一種葡聚糖)之植物;

3) 產生玻璃酸(hyaluronan)之轉殖基因植物。

也可根據本發明被處理之植物或植物栽培品種(得自植物生物技術方法，例如，基因工程法者)為，像是棉花植物，具有改變的纖維特質。這類植物可得自基因轉化或選擇含有加入像是改變的纖維特性之突變的植物且包括:

- a) 植物，例如棉花植物，其含有一種改變的型式之纖維素合成酶基因;
- b) 植物，例如棉花植物，其含有一種改變的型式之 rsw2 或 rsw3 同源的核酸類;
- c) 植物，例如棉花植物，具有一種增加的蔗糖磷酸合成酶表現;
- d) 植物，例如棉花植物，具有一種增加的蔗糖合成酶表現;
- e) 植物，例如棉花植物，其中在纖維細胞的基點之胞質間連絲的門路之時間選擇被改變了，例如經由纖維-選擇性 β -1,3-葡萄糖酶之往下調節;
- f) 植物，例如棉花植物，其具有帶改變了反應性之纖維，例如透過 N-乙酰基葡萄糖胺轉移酶基因之表現，包括 nodC 及幾丁合成酶基因。

也可根據本發明被處理之植物或植物栽培品種(得自植物生物技術方法，例如，基因工程法者)為植物，像是歐洲油菜或相關的薹屬植物，具改變的油分佈特性。這類植物可得自基因轉化，或藉由挑選含有參與這類改變的油特性之突變種且包括:

- a) 植物，例如歐洲油菜植物，其產生具有較高的油酸含量之油;

- b) 植物，例如歐洲油菜植物，其產生具有低的亞麻油酸含量之油，
- c) 植物，例如歐洲油菜植物，其產生具有低量飽和的脂肪酸類之油。

可根據本發明被處理之特別地有用之轉殖基因植物為，包含編碼一或多種毒素之一或多種基因之植物，包括以下述商品名被販售者：YIELD GARD® (例如玉米、棉花、大豆)、KnockOut® (例如玉米)、BiteGard® (例如玉米)、Bt-Xtra® (例如玉米)、StarLink® (例如玉米)、Bollgard® (棉花)、Nucotn® (棉花)、Nucotn 33B® (棉花)、NatureGard® (例如玉米)、Protecta® 及 NewLeaf® (馬鈴薯)。可被提及之耐殺草劑的植物之實例為玉米品種、棉花品種及大豆品種，其商品名為 Roundup Ready® (耐嘉磷塞，例如玉米、棉花、大豆)、Liberty Link® (耐固殺草，例如油菜)、IMI® (耐咪唑啉酮)及 SCS® (耐磺醯基尿素，例如玉米)。可被提及之耐殺草劑的植物(以傳統方式育成用於耐殺草劑之植物)包括以 Clearfield® 之商品名被販售之品種(例如玉米)。

可根據本發明被處理之特別有用之轉殖基因植物為含轉化品項，或轉化品項的組合之植物，其被列於不同國家的或地區的管理局之資料庫中(見，例如 http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx 以及 <http://www.agbios.com/dbase.php>)。

根據本發明，所列示之植物特別有利於以根據本發明之式(I)的化合物處理。上面指明之較佳的活性化合物及混合物之使用範圍也適用於處理這些植物。特別佳者係以明確地在本說明文內指明之化合物處理植物。

根據本發明的組成物或活性化合物也可被使用以保護植物，於

植物被處理後得以對抗上述之病原菌經一段時間，其中保護的期間通常可達 1 至 28 天，較佳的為經活性物質處理植物後 1 至 14 天，特別佳的為 1 至 10 天，極佳的為 1 至 7 天。或在處理種子後用於保護種子達 200 天。

根據本發明之式(I) 的活性化合物之製備及用途被出示於下面的實例中，然而，本發明不限於這些實例。

式(V)的起始材料之製備:

2,5-二氯-N-環丁基嘧啶-4-胺(V-1)

在-10°C 下，將 3.39 克(24.5 毫莫耳)的碳酸鉀加至溶解於 50 毫升的乙腈之 3.00 克(16.4 毫莫耳)的 2,4,5-三氯嘧啶的溶液內，再加入溶解在乙腈內之 20%強度之 1.22 克(17.2 毫莫耳)的環丁基胺溶液。攪拌下，令反應混合物回溫至室溫過夜。將反應混合物攪拌入 250 毫升，含鹽酸的冰-水(1:1)內。混合物以乙酸乙酯萃取(2x 200 毫升)，合併有機層，經水洗滌(2x 100 毫升)並經 MgSO_4 乾燥，減壓下除去溶劑，製得 3.45 克(94%) 的 2,5-二氯-N-環丁基嘧啶-4-胺(V-1) ($\log P$ (pH 2.3): 2.62).

下述化合物可依類似的方法被製備:

5-溴-2-氯-N-環丁基嘧啶-4-胺(V-2) ($\log P$ (pH 2.3): 2.87).

2-氯-N-環丁基-5-碘嘧啶-4-胺(V-3) ($\log P$ (pH 2.3): 3.08).

2-氯-N-環丁基-5-三氟甲基嘧啶-4-胺(V-4)

將 8.07 克(37.2 毫莫耳)的 2,4-二氯-5-三氟嘧啶及 12.8 克(92.9 毫莫耳)的碳酸鉀混合於 150 毫升的乙腈後，加熱至 50°C。然後加入 4.00 克(37.2 毫莫耳)的環丁基胺鹽酸鹽，將此混合物攪拌 2 小時，冷卻後，將混合物攪拌入 500 毫升的冰-水內，以乙酸乙酯萃取 (3x 200

毫升)，合併有機層，以水洗滌(2x 250 毫升)，經 MgSO_4 乾燥，減壓下除去溶劑，製得的粗製品利用管柱層析法。於矽膠上純化(環己烷/乙酸乙酯)，製得 4.00 克(41%)的 2-氯-N-環丁基-5-三氟甲基嘧啶-4-胺(V-4) ($\log P$ (pH 2.3): 3.20)。

式(IV)的化合物之製備

1-(5-胺基-2-噻吩基)乙酮(IV-1, 圖示 6)

在室溫下，將 4.20 克的鐵粉(75.2 毫莫耳)加至溶解於 360 毫升的乙酸之 3.00 克(17.5 毫莫耳)的 1-(5-硝基-2-噻吩基)乙酮溶液，在 75°C 下將混合物攪拌 30 分鐘。冷卻至室溫後，反應混合物被濃縮，置入於 100 毫升的乙酸乙酯及 200 毫升的飽和的碳酸氫鈉溶液。分出有機層，水溶液層再經乙酸乙酯萃取兩遍，合併有機層，經硫酸鈉乾燥，乾燥，減壓下除去溶劑，製得 1.50 克(60%)的所要產物($\log P$ (pH 2.3): 0.42); ^1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ = 7.42 (d, 1 H), 6.67 (s, 2 H), 5.91 (d, 1 H), 2.25 (s, 3 H)。

2-(N-第三-丁氧基羰基胺基)-5-甲基噻吩(IV-3, 圖示 7)

將 3.87 克(14.0 毫莫耳)的二苯基磷醯基疊氮化物及 1.42 克(14.0 毫莫耳)的三乙基胺加至溶解於 20 毫升的乾燥第三-丁醇的 2.00 克(14.0 毫莫耳)的 5-甲基噻吩-2-羧酸溶液內。在 85°C 下將反應混合物加熱 14 小時。冷卻至室溫後，加入 100 毫升的水，混合物以乙酸乙酯萃取，合併有機層，經硫酸鈉乾燥，過濾。減壓下除去溶劑，粗製品再藉由管柱層析法純化(環己烷/乙酸乙酯 4:1)，製得 2.10 克(70%)的所頂產物 ($\log P$ (pH 2.3): 2.89); ^1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ = 9.35 (s, 1 H), 6.41-6.43 (m, 1 H), 6.31 (d, 1 H), 2.30 (s, 3 H), 1.45 (s, 9 H)。

式(I)的化合物之製備

N^4 -環丙基- N^2 -2-乙醯基噻吩-5-基-5-(氯)嘧啶-2,4-二胺(實例 10, 圖示 2)

將 863 毫克 (4.23 毫莫耳) 的 2-氯-N-環丙基-5-(氯)嘧啶-4-胺、717 毫克 (5.07 毫莫耳) 的 1-(5-胺基-2-噻吩基)乙酮及 644 毫克 (3.38 毫莫耳) 的 4-甲苯磺酸混合於 50 毫升的二噁烷後，在 105°C 下攪拌 16 小時，冷卻後，將反應混合物攪拌入冰-水，並以乙酸乙酯萃取 (3x 100 毫升)，合併有機層，經 Na_2SO_4 乾燥，過濾，減壓下除去溶劑、藉由管柱層析法純化(環己烷/乙酸乙酯 1:1)，製得 806 毫克(62%)的所要產物 ($\log P$ (pH 2.3): 1.87); ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ = 8.01 (s, 1 H), 7.64 (d, 1 H), 7.24 (s, 1 H), 6.69 (d, 1 H), 2.95-3.00 (m, 1 H), 2.37 (s, 3 H), 0.84-0.88 (m, 2H), 0.70-0.73 (m, 2H)。

式 (Ia) 的化合物之製備

5-氯- N^4 -環丙基- N^2 -2-甲氧基羰基噻吩-4-基-2,4-二胺(實例 5, 圖示 2)

將 250 毫克 (1.23 毫莫耳) 的 5-氯-2-氯-N-環丙基嘧啶-4-胺、231 毫克 (1.47 毫莫耳) 的甲基 4-胺基噻吩-2-羧酸酯及 186 毫克 (0.98 毫莫耳) 的 4-甲苯磺酸混合於 12 毫升的二噁烷後，在 105°C 下攪拌 18 小時，冷卻後，將反應混合物攪拌入冰-水內，以乙酸乙酯萃取 (3x 100 毫升)。合併有機層，以 50 毫升飽和的 NaHCO_3 水溶液洗滌，經 Na_2SO_4 乾燥，過濾，減壓下除去溶劑，製得 200 毫克(50%)的所要產物 ($\log P$ (pH 2.3): 1.68); ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ = 9.56 (s, 1 H), 8.07 (s, 1 H), 7.92 (s, 1 H), 7.86 (s, 1 H), 7.06 (s, 1 H), 3.80 (s, 3 H), 2.83-2.86 (m, 1 H), 0.79-0.84 (m, 2H), 0.63-0.67 (m, 2H)。

式 (Ib) 的化合物之製備

5-氯- N^4 -環丙基- N^2 -2-羥基羰基噻吩-4-基-2,4-二胺(實例 37, 圖示 9)

將 345 毫克(3.08 毫莫耳)的第三-丁氧基鉀加至 500 毫克(1.54 毫莫耳)的 5-氯-N⁴-環丙基-N²-2-甲氧基羰基噻吩-4-基-2,4-二胺與 20 毫升的水之混合物中，在 100°C 下將混合物攪拌 3 小時。冷卻至室溫後，以稀鹽酸酸化，吸引濾下所得的固體，乾燥，製得 300 毫克(63%)的所要產物 (logP (pH 2.3): 1.30); ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ = 7.97-7.98 (m, 2 H), 7.83 (d, 1 H), 7.52 (s, 1 H), 2.85-2.87 (m, 1 H), 0.82-0.86 (m, 2H), 0.67-0.71 (m, 2H)。

● 式 (Ic) 的化合物之製備

5-氯-N⁴-環丙基-N²-2-吡咯啉-1-基羰基噻吩-4-基-2,4-二胺(實例 6, 圖示 10)

將 150 毫克(0.48 毫莫耳)的 5-氯-N⁴-環丙基-N²-2-羥基羰基噻吩-4-基-2,4-二胺、29 毫克(0.41 毫莫耳)的吡咯啉、281 毫克的 Pybrop (0.60 毫莫耳) 及 104 毫克(0.81 毫莫耳)的二異丙基乙基胺混合於 10 毫升的二氯甲烷後，在室溫下攪拌 24 小時，反應混合物經水洗滌後，以硫酸鈉乾燥，過濾，濃縮，粗製品再藉由管柱層析法純化(環己烷/乙酸乙酯 1:1)，製得 80 毫克(46%)所要的產物 (logP (pH 2.3): 1.40); ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ = 9.40 (s, 1H), 7.91 (s, 1 H), 7.81 (d, 1 H), 7.72 (d, 1 H), 7.10 (s, 1 H), 3.56-3.58 (m, 4 H), 2.85-2.87 (m, 1 H), 1.90-1.92 (m, 4 H), 0.76-0.80 (m, 2H), 0.64-0.67 (m, 2H)。

● 式 (I) 的化合物之製備

5-氯-N⁴-環丙基-N²-2-甲基噻吩-5-基-2,4-二胺(實例 26, 圖示 8)

將 200 毫克(0.98 毫莫耳)的 5-氯-2-氯-N-環丙基嘧啶-4-胺、251 毫克(1.17 毫莫耳)的 2-(N-第三-丁氧基羰基胺基)-5-甲基噻吩及 149 毫克(0.78 毫莫耳)的 4-甲苯磺酸混合於 12 毫升的二噁烷後，在 105°C

下攪拌 18 小時，冷卻後，反應混合物被攪拌入冰-水並以乙酸乙酯萃取 (3x 100 毫升)。合併有機層，以 50 毫升飽和的 NaHCO_3 水溶液洗滌並以 Na_2SO_4 乾燥，過濾並在減壓下除去溶劑，粗製品再經管柱層析法純化(環己烷/乙酸乙酯 1:1)，製得 275 毫克(83%)的所要的產物 ($\log P$ (pH 2.3): 2.09); ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ = 7.87 (s, 1 H), 6.94 (s, 1 H), 6.43-6.47 (m, 2 H), 2.96-3.00 (m, 1 H), 2.31 (s, 3 H), 0.74-0.80 (m, 2H), 0.67-0.69 (m, 2H)。

式 (IX) 的起始材料之製備

2-(噻吩-3-基胺基)-5-氯嘧啶-4(3H)-酮 (IX-1, 圖示 3)

將包含 3.27 毫升的 1M NaOH 溶液(aq.)及 1 毫升的水之溶液加至溶解在 10 毫升的二噁烷中之 500 毫克(2.73 毫莫耳)的 2,4,5-三氯嘧啶溶液內，在室溫下經 4 天的攪拌後，減壓下將反應混合物濃縮。殘留物被放入至 50 毫升的乙酸乙酯中，以 1 N HCl (aq.)中和，分出有機層，經 10 毫升的水洗滌，經 MgSO_4 乾燥，減壓下除去溶劑，製得的粗製品，與 445 毫克(4.55 毫莫耳)的 3-胺基噻吩及 532 毫克(3.09 毫莫耳)的 4-甲苯磺酸，置入於 10 毫升的二噁烷內，在 105°C 下攪拌加熱，18 小時後，減壓下將反應混合物濃縮，殘留物被置入於 50 毫升的乙酸乙酯內。有機層以 10 毫升的飽和的 NaHCO_3 水溶液、10 毫升的水洗滌後，經 MgSO_4 乾燥，減壓下除去溶劑，製得 500 毫克的 2-(噻吩-3-基胺基)-5-氯嘧啶-4(3H)-酮 (IX-1)，其在未進一步精製下被直接地反應($\log P$ (pH2.3): 1.38)。

式 (X, 圖示 4) 的起始材料之製備:

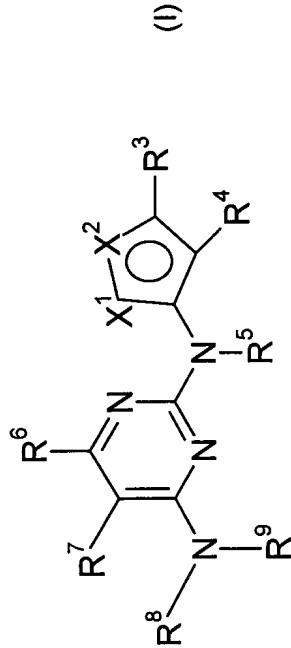
4,5-二氯-N-(3-噻吩基)嘧啶-2-胺(X-1)

將 400 毫克的 2-(噻吩-3-基胺基)-5-氯嘧啶-4(3H)-酮溶解於 2 毫

升的磷鹽基氯後，在 95°C 下加熱 18 小時，冷卻後，減壓下將反應混合物濃縮，加至水中並以二氯甲烷萃取(3 x 20 毫升)，合併有機層，經 MgSO₄ 乾燥，減壓下除去溶劑，製得 450 毫克的 4,5-二氯-N-(3-噻吩基)嘧啶-2-胺(X-1) (logP (pH 2.3): 3.55); ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ = 9.70 (s, 1 H), 8.33 (s, 1 H), 7.65-7.67 (m, 1 H), 7.47-7.49 (m, 1 H), 7.41-7.43 (m, 1 H)。

實例

被列於下面表中之式 I 之化合物可使用類似於上述的方法取得。



其中 X¹ = S 或 CR¹
X² = S 或 CR²

表 I

實例	X ¹	R ₁	X ²	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	logp	[M+H] ⁺	1H-NMR 69 in ppm [d]
1	CR ¹	H	S		H	H	H	H	氯	H	環丙基	1.63[b]	267	9.37 (s, 1 H), 7.89 (s, 1 H), 7.64-7.63 (q, 1 H), 7.34-7.32 (q, 1 H), 7.24-7.22 (q, 1 H), 6.95 (s, 1 H), 2.89-2.84 (m, 1 H), 0.78-0.75 (m, 2 H), 0.67-0.63 (m, 2 H).
2	CR ¹	H	S		H	H	H	H	CF ₃	H	環丙基	2.69[b]	301	9.03 (s, 1 H), 8.16 (s, 1 H), 7.72 (d, 1 H), 7.36-7.38 (m, 1 H), 7.28-7.29 (m, 1 H), 6.80 (s, 1 H), 2.88-2.93 (m, 1 H), 0.77-0.82 (m, 2 H), 0.66-0.69 (m, 2 H).
3	CR ¹	H	S		H	H	H	H	溴	H	環丁基	2.12[b]	326/328	9.30 (s, 1 H), 7.99 (s, 1 H),

實 例	X ¹	R ₁ ²	X ²	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	logp	[M+H] ⁺	1H-NMR 69 in ppm [d]
														7.43-7.45 (m, 1 H), 7.33-7.35 (m, 1 H), 7.18-7.20 (m, 1 H), 6.64 (d, 1 H), 4.52-4.55 (m, 1 H), 2.11-2.32 (m, 4 H), 1.68-1.75 (m, 2 H).
4	CR ¹	H	S		H	H	H	H	溴	H	環丙基	1.71[b]		9.4 (s, 1 H), 7.98 (s, 1 H), 7.64 (q, 1 H), 7.34-7.32 (q, 1 H), 7.24-7.22 (q, 1 H), 6.72 (s, 1 H), 2.89-2.80 (m, 1 H), 0.79-0.73 (m, 2 H), 0.67-0.63 (m, 2 H).
5	CR ¹	H	S		甲氧基-羰基	H	H	H	氯	H	環丙基	1.68[a]	325	9.56 (s, 1 H), 8.07 (s, 1 H), 7.92 (s, 1 H), 7.86 (s, 1 H), 7.06 (s, 1 H), 3.80 (s, 3 H), 2.83-2.86 (m, 1 H), 0.79-0.84 (m, 2H), 0.63-0.67 (m, 2H).
6	CR ¹	H	S		吡咯啉-1-基-羰基	H	H	H	氯	H	環丙基	1.42[a]	364	9.40 (s, 1H), 7.91 (s, 1 H), 7.81 (d, 1 H), 7.72 (d, 1 H), 7.10 (s, 1 H), 3.56-3.58 (m, 4 H), 2.85-2.87 (m, 1 H), 1.90-1.92 (m, 4 H), 0.76-0.80 (m, 2H), 0.64-0.67 (m, 2H).
7	CR ¹	H	S		六氫吡啶-1-基-羰基	H	H	H	氯	H	環丙基	1.68[a]	378	9.42 (s, 1H), 7.90 (s, 1 H), 7.75 (d, 1 H), 7.48 (d, 1 H), 7.01 (s, 1 H), 3.57-3.65 (m, 4 H), 2.83-2.87 (m, 1 H),

實例	X ¹	R _i ¹	X ²	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	logp	[M+H] ⁺	1H-NMR 69 in ppm [d]
														1.51-1.65 (m, 6 H), 0.75-0.79 (m, 2H), 0.64-0.67 (m, 2H).
8	CR ¹	H	S		甲基(丙-2-基)-胺基 鹽基	H	H	H	氯	H	環丙基	1.6[a]	366	9.51 (s, 1H), 7.93 (s, 1 H), 7.76 (d, 1 H), 7.52 (d, 1 H), 7.16 (s, 1 H), 4.51-4.55 (m, 1 H), 2.91 (s, 3 H), 2.58-2.59 (m, 1 H), 1.12 (d, 6H), 0.77-0.79 (m, 2H), 0.66-0.68 (m, 2H).
9	CR ¹	H	S		二乙基-胺 基甲鹽基	H	H	H	氯	H	環丙基	1.62[a]	366	9.45 (s, 1H), 7.91 (s, 1 H), 7.77 (d, 1 H), 7.52 (d, 1 H), 7.01 (s, 1 H), 3.47 (q, 4 H), 2.84-2.87 (m, 1 H), 1.17 (tr, 6 H), 0.75-0.79 (m, 2H), 0.64-0.67 (m, 2H).
10	S		CR ²	乙鹽基	H	H	H	H	氯	H	環丙基	1.87[a]	309	8.01 (s, 1 H), 7.64 (d, 1 H), 7.24 (s, 1 H), 6.69 (d, 1 H), 2.95-3.00 (m, 1 H), 2.37 (s, 3 H), 0.84-0.88 (m, 2H), 0.70-0.73 (m, 2H).
11	S		CR ²	(1E)- N-甲氧 基-乙 亞胺鹽 基	H	H	H	H	氯	H	環丙基	2.98[a]	338	主異構物: 7.95 (s, 1 H), 7.26 (d, 1 H), 7.21 (s, 1 H), 7.16 (s, 1 H), 7.06 (d, 1 H), 3.81 (s, 3 H), 2.98-3.02 (m, 1 H), 2.16 (s, 3 H), 0.80-0.89 (m, 2H), 0.71-0.79 (m, 2H).

實例	X ¹	R ₁	X ²	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	logp	[M+H] ⁺	1H-NMR 69 in ppm [d]
12	S		CR ²	H	氰基	H	H	H	氯	H	環丙基	2.55[a]	292	8.56 (d, 1 H), 8.03 (s, 1 H), 7.60 (d, 1 H), 7.31 (s, 1 H), 6.69 (d, 1 H), 2.94-3.02 (m, 1 H), 0.80-0.86 (m, 2H), 0.71-0.74 (m, 2H).
13	CR ¹	H	S		乙醯基	H	H	H	氯	H	環丙基	1.44[a]	309	8.00 (d, 1 H), 7.94 (d, 1 H), 7.92 (s, 1 H), 7.05 (s, 1 H), 3.57 (s, 3 H), 2.81-2.89 (m, 1 H), 0.77-0.80 (m, 2H), 0.64-0.66 (m, 2H).
14	CR ¹	H	S		氰基	H	H	H	氯	H	環丙基	2.23[a]	292	9.68 (s, 1 H), 7.99 (m, 2 H), 7.93 (s, 1 H), 7.09 (s, 1 H), 2.83-2.87 (m, 1 H), 0.76-0.81 (m, 2H), 0.63-0.67 (m, 2H).
15	S		CR ²	甲氧基 羰基	H	H	H	H	氯	H	環丙基	2.25[a]	325	8.01 (s, 1 H), 7.53 (d, 1 H), 7.24 (s, 1 H), 6.70 (d, 1 H), 3.73 (s, 3 H), 2.95-3.00 (m, 1 H), 0.83-0.87 (m, 2H), 0.70-0.74 (m, 2H).
16	S		CR ²	氰基	H	H	H	H	氯	H	環丙基	2.62[c]; 2.55[b]	292	8.55 (d, 1 H), 8.02 (s, 1 H), 7.60 (d, 1 H), 7.30 (s, 1 H), 6.69 (d, 1 H), 2.94-3.04 (m, 1 H), 0.82-0.89 (m, 2H), 0.71-0.74 (m, 2H).
17	CR ¹	H	S		H	H	H	H	氯	H	2-甲基-環丙基	1.97[a]	281	main isomer: 9.32 (s, 1 H), 7.89 (s, 1 H), 7.62-7.63 (m, 1 H), 7.32-7.34 (m, 1 H), 7.22-7.24 (m, 1 H), 6.89 (s,

實例	X ¹	R _i ¹	X ²	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	logp	[M+H] ⁺	1H-NMR 69 in ppm [d]
														1 H), 2.55-2.60 (m, 1 H), 1.12 (d, 3 H), 0.94-0.95 (m, 1H), 0.84-0.89 (m, 1H), 0.51-0.59 (m, 1 H).
18	CR ¹	H	S		H	H	H	H	氣	H	環丁基	3.46[c]; 1.96[b]	281	9.28 (s, 1 H), 7.90 (s, 1 H), 7.44-7.45 (m, 1 H), 7.33-7.35 (m, 1 H), 7.18-7.20 (m, 1 H), 6.91 (d, 1 H), 4.51-4.57 (m, 1 H), 2.26-2.31 (m, 2 H), 2.09-2.19 (m, 2H), 1.66-1.76 (m, 2H).
19	CR ¹	H	S		嗎啉-4-基-羧基	H	H	H	氣	H	環丙基	2.09[c]; 1.45[b]	380	9.40 (s, 1 H), 7.91 (s, 1 H), 7.78 (d, 1 H), 7.53 (d, 1 H), 7.02 (s, 1 H), 3.63 (s, 8 H), 2.83-2.86 (m, 1 H), 0.75-0.79 (m, 2H), 0.64-0.67 (m, 2H).
20	CR ¹	H	S		第三-丁基 胺基甲鹽基	H	H	H	氣	H	環丙基	2.11[b]	364	9.32 (s, 1 H), 8.05 (d, 1 H), 7.92 (s, 1 H), 7.82 (d, 1 H), 7.05 (s, 1 H), 2.64-2.66 (m, 1 H), 1.35 (s, 9 H), 0.81-0.84 (m, 2H), 0.63-0.67 (m, 2H).
21	CR ¹	H	S		丙-2-烯-1-基 胺基甲鹽基	H	H	H	氣	H	環丙基	2.28[c]	350	9.45 (s, 1 H), 8.33 (s, 1 H), 7.90 (s, 1 H), 7.78 (d, 1 H), 7.74 (d, 1 H), 7.01 (s, 1 H), 5.85-5.90 (m, 1 H), 5.05-5.19 (m, 2 H), 3.82-3.85

實 例	X ¹	R _i ²	X ²	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	logp	[M+H] ⁺	1H-NMR 69 in ppm [d]
														(m, 2 H), 2.85-2.92 (m, 1 H), 0.75-0.78 (m, 2H), 0.64-0.66 (m, 2H.)
22	CR ¹	H	S		甲基(丙-2-烯-1-基)胺基甲鹽基	H	H	H	氯	H	環丙基	2.65[c]; 1.89[b]	364	9.42 (s, 1 H), 7.90 (s, 1 H), 7.79 (d, 1 H), 7.58 (d, 1 H), 7.00 (s, 1 H), 5.85-5.93 (m, 1 H), 5.20-5.26 (m, 2 H), 4.08-4.10 (m, 2 H), 3.12 (s, 3 H), 2.86-2.90 (m, 1 H), 0.73-0.78 (m, 2H), 0.66-0.68 (m, 2H).
23	CR ¹	H	S		(2-甲氧基-乙基)胺基甲鹽基	H	H	H	氯	H	環丙基	2.01[c]; 1.38[b]	366	9.50 (s, 1 H), 8.12 (s, 1 H), 7.92 (s, 1 H), 7.77 (d, 1 H), 7.74 (d, 1 H), 7.11 (s, 1 H), 3.60-3.64 (m, 2 H), 3.37-3.46 (m, 2 H), 3.29 (s, 3 H), 2.88-2.92 (m, 1 H), 0.77-0.79 (m, 2H), 0.65-0.67 (m, 2H).
24	CR ¹	H	S		(1-甲氧基-丙-2-基)-胺基甲鹽基	H	H	H	氯	H	環丙基	2.22[c]; 1.58[b]	382	9.69 (s, 1 H), 7.97 (s, 1 H), 7.83 (d, 1 H), 7.73 (d, 1 H), 7.48 (s, 1 H), 4.62-4.12 (m, 1 H), 3.60-3.62 (m, 1 H), 3.38-3.41 (m, 1 H), 3.28 (s, 3 H), 3.01-3.05 (m, 1 H), 1.12 (d, 3 H), 0.78-0.82 (m, 2H), 0.58-0.62 (m, 2H).
25	CR ¹	H	S		羥基-胺基	H	H	H	氯	H	環丙基	2.96[c]; 2.1[b]	325	8.06 (d, 1 H), 7.92 (s, 1 H), 7.86 (d, 1 H), 7.05 (s, 1 H),

實例	X ¹	R _i ¹	X ²	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	logp	[M+H] ⁺	¹ H-NMR 69 in ppm [d]
					甲醯基									3.80 (s, 1 H), 2.83-2.89 (m, 1 H), 0.80-0.83 (m, 2H), 0.64-0.66 (m, 2H).
26	S		CR ²	CH ₃	H	H	H	H	氯	H	環丙基	3.20[c]; 2.09[b]	281	7.87 (s, 1 H), 6.94 (s, 1 H), 6.43-6.47 (m, 2 H), 2.96-3.00 (m, 1 H), 2.31 (s, 3 H), 0.74-0.80 (m, 2H), 0.67-0.69 (m, 2H).
27	CR ¹	H	S		H	H	H	H	氯	H	丙-2-基	3.28[c]; 1.66[b]	269	9.29 (s, 1 H), 7.89 (s, 1 H), 7.42-7.43 (m, 1 H), 7.32-7.34 (m, 1 H), 7.18-7.20 (m, 1 H), 6.40 (d, 1 H), 4.30-4.34 (m, 1 H), 1.24 (d, 6 H).
28	CR ¹	H	S		H	H	H	H	溴	H	丙-2-基	3.43[c]; 1.85[b]	314/316	9.31 (s, 1 H), 7.98 (s, 1 H), 7.41-7.42 (m, 1 H), 7.33-7.35 (m, 1 H), 7.18-7.20 (m, 1 H), 6.12 (d, 1 H), 4.27-4.33 (m, 1 H), 1.24 (d, 6 H).
29	CR ¹	H	S		H	H	H	H	溴	H	2,2,2-三氯乙基	3.50[c]	354/356	9.42 (s, 1 H), 8.70 (s, 1 H), 8.18 (s, 1 H), 7.38-7.39 (m, 1 H), 7.34-7.35 (m, 1 H), 7.15-7.16 (m, 1 H), 4.11-4.13 (m, 2 H).
30	CR ¹	H	S		H	H	H	H	溴	H	2,2-二氯乙基	2.83[c]; 1.99[b]	336/338	9.41 (s, 1 H), 8.06 (s, 1 H), 7.38-7.39 (m, 1 H), 7.34-7.36 (m, 1 H), 7.17-7.19 (m, 1 H), 7.05 (s, 1 H),

實 例	X ¹	R ₁ ^{X²}	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	logp	[M+H] ⁺	1H-NMR 69 in ppm [d]
													6.05-6.35 (m, 1 H), 3.79-3.83 (m, 2 H).
31	CR ¹	H S		H	H	H	H	氯	H	2,2-二氟 乙基	2.72[c]; 1.88[b]	291	9.39 (s, 1 H), 7.98 (s, 1 H), 7.39-7.40 (m, 1 H), 7.23 (s, 1 H), 7.34-7.36 (m, 1 H), 7.17-7.19 (m, 1 H), 6.05- 6.33 (m, 1 H), 3.80-3.83 (m, 2 H).
32	CR ¹	H S		H	H	H	H	氯	H	環丙基甲 基	3.31[c]; 2.33[b]	281	9.28 (s, 1 H), 7.90 (s, 1 H), 7.43-7.45 (m, 1 H), 7.32- 7.34 (m, 1 H), 7.18-7.20 (m, 1 H), 6.92 (s, 1 H), 3.24-3.33 (m, 2 H), 1.13- 1.18 (m, 1 H), 0.41-0.45 (m, 2 H), 0.26-0.29 (m, 2 H).
33	S	CR ²	甲基- 磺醯基	H	H	H	H	氯	H	環丙基	2.02[c]; 1.97[b]	343	7.98 (s, 1 H), 7.43 (d, 1 H), 7.09 (s, 1 H), 6.61 (d, 1 H), 3.57 (s, 3 H), 2.93-2.98 (m, 1 H), 0.79-0.86 (m, 2H), 0.72-0.81 (m, 2H).
34	S	CR ²	甲基- 硫烷基	H	H	H	H	氯	H	環丙基	3.36[c]; 2.84[b]	313	7.93 (s, 1 H), 7.08 (s, 1 H), 6.88 (d, 1 H), 6.53 (d, 1 H), 2.93-2.98 (m, 1 H), 2.35 (s, 3 H), 0.78-0.83 (m, 2H), 0.69-0.71 (m, 2H).
35	S	CR ²	甲基- 硫烷基	H	H	H	H	溴	H	環丙基	3.53[c]; 3.02[b]	358/360	8.01 (s, 1 H), 6.88 (d, 1 H), 6.82 (s, 1 H), 6.53 (d, 1 H), 2.93-2.98 (m, 1 H), 2.35 (s,

實 例	X ¹	R ₁	X ²	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	logp	[M+H] ⁺	1H-NMR 69 in ppm [d]
														3 H), 0.78-0.82 (m, 2H), 0.69-0.71 (m, 2H).
36	S		CR ²	CH ₃	H	H	H	H	CF ₃	H	環丙基	3.56[c]; 3.22[b]	315	8.14 (s, 1 H), 6.76 (s, 1 H), 6.56 (d, 1 H), 6.48 (d, 1 H), 3.56 (s, 3 H), 3.03-3.05 (m, 1 H), 0.78-0.82 (m, 2H), 0.68-0.71 (m, 2H).
37	CR ¹	H	S		羥基羰基	H	H	H	Cl	H	環丙基	0.74[c]; 1.30[b]	311	8.02 (s, 1 H), 7.99 (d, 1 H), 7.83 (d, 1 H), 7.69 (s, 1 H), 3.44 (s, 1 H), 2.84-2.94 (m, 1 H), 0.83-0.88 (m, 2H), 0.71-0.73 (m, 2H).
38	CR ¹	H	S		甲基(環-丙 基甲基)胺 基甲醯基	H	H	H	Cl	H	環丙基	2.86[c]; 2.08[b]	378	7.96 (s, 1 H), 7.78 (d, 1 H), 7.58 (d, 1 H), 3.61-3.66 (m, 1 H), 3.13 (s, 3 H), 3.11- 3.15 (m, 2 H), 0.81-0.83 (m, 2 H), 0.71-0.75 (m, 2H), 0.50-0.55 (m, 2H), 0.23-0.26 (m, 2 H).
39	CR ¹	H	S		吡咯啉-1- 基硫羰基	H	H	H	Cl	H	環丙基	3.23[c]; 2.31[b]	380	9.36 (s, 1 H), 7.91 (s, 1 H), 7.78 (d, 1 H), 7.56 (d, 1 H), 7.04 (s, 1 H), 3.83-3.86 (m, 2 H), 3.61-3.66 (m, 2 H), 2.85-2.88 (m, 1 H), 1.96- 2.00 (m, 2 H), 0.75-0.78 (m, 2H), 0.65-0.67 (m, 2H).
40	CR ¹	H	S		二乙基硫胺	H	H	H	Cl	H	環丙基	3.51[c]; 2.55[b]	382	9.42 (s, 1 H), 7.91 (s, 1 H), 7.70 (d, 1 H), 7.31 (d, 1 H),

實例	X ¹	R _i ¹	X ²	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	logp	[M+H] ⁺	1H-NMR 69 in ppm [d]
					基甲醯基									7.03 (s, 1 H), 3.72-3.85 (m, 4 H), 2.83-2.86 (m, 1 H), 1.26 (tr, 6 H), 0.75-0.78 (m, 2H), 0.64-0.67 (m, 2H).
41	CR ¹	H	S		氣	H	H	H	Cl	H	環丙基	2.63[b]	302	9.41 (s, 1 H), 7.90 (s, 1 H), 7.42 (d, 1 H), 7.26 (d, 1 H), 6.98 (s, 1 H), 2.79-2.83 (m, 1 H), 0.76-0.79 (m, 2H), 0.51-0.53 (m, 2H).
42	CR ¹	H	S		H	H	H	H	Cl	H	2-(三氣甲基)環丙基		335	
43	S		CR ²	氣	H	H	H	H	Cl	H	環丙基	3.54[c]; 3.08[b]	302	7.93 (s, 1 H), 7.10 (s, 1 H), 6.76 (d, 1 H), 6.44 (d, 1 H), 2.93-2.98 (m, 1 H), 2.31 (s, 3 H), 0.71-0.82 (m, 2H), 0.67-0.69 (m, 2H).
44	S		CR ²	甲基	H	H	H	H	Br	H	環丙基	3.35[c]; 2.27[b]	326/328	7.96 (s, 1 H), 6.69 (s, 1 H), 6.43-6.47 (m, 2 H), 2.95-3.00 (m, 1 H), 0.72-0.80 (m, 2H), 0.65-0.69 (m, 2H).
45	S		CR ²	甲基	H	H	H	H	H	H	環丙基	1.32[b]	247	7.96 (d, 1 H), 7.83 (d, 1 H), 6.42 (s, 1 H), 5.96-5.99 (m, 2 H), 2.65-2.67 (m, 1 H), 2.30 (s, 3 H), 0.71-0.76 (m, 2H), 0.49-0.52 (m, 2H).

logP 值係根據 EEC directive 79/831 Annex V.A8，由 HPLC (高性能液相層析法)，於反相管柱(C 18)上測定，使用下述的方法：

[a] 酸性範圍中的測定係在 pH 2.3 下進行，使用移動相 0.1% 磷酸水溶液與乙腈，線性梯度為自 10% 乙腈至 95% 乙腈。

[b] 酸性範圍中的 LC-MS 測定係在 pH 2.7 下進行，使用移動相 0.1% 甲酸水溶液及乙腈 (含 0.1% 甲酸)，線性梯度為自 10% 乙腈至 95% 乙腈。

[c] 在中性範圍中之 LC-MS 測定係在 pH 7.8 下，使用移動相 0.001 莫耳水性碳酸氫銨 溶液及乙腈，自 10% 乙腈至 95% 乙腈的線性梯度下進行。

校正係使用(具有 3 至 16 個碳原子)之不分枝的烷-2-酮類，具有已知的 logP 值進行 (logP 值的測定係使用線性內插法藉由滯留時間計算介於兩個相繼的烷酮類)。lambda-max 值係使用自 200 nm 至 400 nm 間的 UV 光譜測得的最大呈色信號值。

[d] 化學的 NMR 位移(ppm) 係於 400 MHz 下測定，除非另有指示在溶劑 DMSO-d₆ 內，使用四甲基矽烷作為內在的標準。

下述縮寫代表信號分裂成：

s = 單峰, d = 雙峰, t = 三峰, q = 四峰, m = 多峰

使用實例

實例 A

黑星病(*Venturia*)試驗 (蘋果)/保護性

溶劑： 24.5 份重的丙酮
24.5 份重的二甲基乙醯胺

乳化劑： 1 份重的烷基芳基聚甘醇醚

為產生一種適合的活性化合物配製劑，將 1 份重的活性化合物
● 與所述量的溶劑及乳化劑混合，以水將此濃縮物稀釋至所要的濃度。

為試驗保護性活性，以所述施用率，對幼年植物噴灑活性化合物配製劑。待噴灑層乾後，植物被接種蘋果黑星病原菌(*Venturia inaequalis*)之分生孢子懸浮液，留置在約 20°C 及 100%相對濕度之接種室內一天。

然後將植物置於 21°C 及約 90%相對濕度之溫室內。

接種十天後進行評估。0%代表相當於對照組之效力，而 100%代表未見到有被感染現象。

● 此試驗中，在上述表 I 中編號 1、2、4、7、8、9、17 及 18 之化合物，在施用 100 ppm 濃度的活性化合物下，具有 70%或更大的效力。

實例 B

灰葡萄孢(*Botrytis*)試驗 (豆子)/保護性

溶劑： 24.5 份重的丙酮
24.5 份重的二甲基乙醯胺

乳化劑： 1 份重的烷基芳基聚甘醇醚

為產生一種適合的活性化合物配製劑，將 1 份重的活性化合物與所述量的溶劑及乳化劑混合，以水將此濃縮物稀釋至所要的濃度。

為試驗保護性活性，以所述施用率，對幼年植物噴灑活性化合物配製劑。待噴灑層乾後，在各葉片上放置生長了灰霉菌(*Botrytis cinerea*)之兩小片洋菜膠，將被接種了的植物置於約 20°C 及 100%相對大氣濕度之暗室內一天。

於接種 2 天後評估葉上被感染的面積。0%代表相當於對照組之效力，而 100%代表未見到有被感染現象。

此試驗中，在上述表 I 中編號 2、4、7、8、17 及 18 之化合物，在施用 100 ppm 濃度的活性化合物下，具有 70%或更大的效力。

實例 C

白粉病菌(*Sphaerotheca*)試驗 (黃瓜)/保護性

溶劑: 49 份重的 N,N-二甲基甲醯胺

乳化劑: 1 份重的烷基芳基聚甘醇醚

為產生一種適合的活性化合物配製劑，將 1 份重的活性化合物與所述量的溶劑及乳化劑混合，以水將此濃縮物稀釋至所要的濃度。

為試驗保護性活性，以所述施用率，對幼年植物噴灑活性化合物配製劑。經處理一天後，植物被接種上白粉菌(*Sphaerotheca fuliginea*)之孢子懸浮液，然後將植物置於 23°C 及 70%相對濕度之溫室內。

於接種 7 天後進行評估，0%代表相當於對照組之效力，而 100%代表未見到有被感染現象。

此試驗中，在上述表 I 中編號 1、2、4、7、8、9、36 及 40 之化

合物，在施用 500 ppm 濃度的活性化合物下，具有 70%或更大的效力。

實例 D

鏈格菌(*Alternaria*)試驗 (蕃茄)/保護性

溶劑: 49 份重之 N,N-二甲基甲醯胺

乳化劑: 1 份重的烷基芳基聚甘醇醚

為產生一種適合的活性化合物配製劑，將 1 份重的活性化合物與所述量的溶劑及乳化劑混合，以水將此濃縮物稀釋至所要的濃度。

為試驗保護性活性，以所述施用率，對幼年蕃茄植物噴灑活性化合物配製劑。經處理一天後，植物被接種上蕃茄早疫病菌 (*Alternaria solani*) 的孢子懸浮液，保持於 22°C、100%相對濕度之下 24 小時，再將植物置於 20°C 及 96%相對濕度。

於接種 7 天後進行評估，0%代表相當於對照組之效力，而 100%代表未見到有被感染現象。

此試驗中，在上述表 I 中編號 1、6、7、8、9、13、14、17、18、19、21、22、24、26 及 38 之化合物，在施用 500 ppm 濃度的活性化合物下，具有 70%或更大的效力。

實例 E

小球腔菌(*Leptosphaeria nodorum*)試驗 (小麥)/保護性

溶劑: 49 份重的 N,N-二甲基甲醯胺

乳化劑: 1 份重的烷基芳基聚甘醇醚

為產生一種適合的活性化合物配製劑，將 1 份重的活性化合物與所述量的溶劑及乳化劑混合，以水將此濃縮物稀釋至所要的濃度。

為試驗保護性活性，以所述施用率，對幼年小麥植物噴灑活性化合物配製劑。經處理一天後，植物被接種上 *Leptosphaeria nodorum* 的水性孢子懸浮液，保持於 22°C、100%相對濕度之下 48 小時，再將植物置於 22°C 及 90%相對濕度之溫室內。

於接種 7-9 天後進行評估，0%代表相當於對照組之效力，而 100%代表未見到有被感染現象。

此試驗中，在上述表 I 中編號 1、2、3、4、6、7、8、9、13、14、17、18、19、21、22、23、24、26、27、28、30、31、32、36、38、39、40 及 41 之化合物，在施用 500 ppm 濃度的活性化合物下，具有 70%或更大的效力。

實例 F

殼針孢菌(*Septoria tritici*)試驗 (小麥)/保護性

溶劑: 50 份重之 N,N-二甲基乙醯胺

乳化劑: 1 份重的烷基芳基聚甘醇醚

為產生一種適合的活性化合物配製劑，將 1 份重的活性化合物與所述量的溶劑及乳化劑混合，以水將此濃縮物稀釋至所要的濃度。

為試驗保護性活性，以所述施用率，對幼年蕃茄植物噴灑活性化合物配製劑。待噴灑層乾後，植物被噴灑上 *Septoria tritici* 的孢子懸浮液，植物被保留在 20°C 及 100%相對濕度之接種室內經 48 小時，再將植物移置於 15°C 及 100%相對濕度之透明罩子下再經 60 小

時。

植物被置於約 15°C 及 80%相對濕度之溫室內。

於接種 21 天後進行評估，0%代表相當於對照組之效力，而 100%代表未見到有被感染現象。

此試驗中，在上述表 I 中編號 1、2、4、7、8、9、13、18 及 40 之化合物，在施用 500 ppm 濃度的活性化合物下，具有 70%或更大的效力。

實例 G

稻熱病(*Pyricularia*)試驗(水稻)/保護性

溶劑: 28.5 份重的丙酮

乳化劑: 1.5 份重的烷基芳基聚甘醇醚

為產生一種適合的活性化合物配製劑，將 1 份重的活性化合物與所述量的溶劑混合，以水及所述量的乳化劑將此濃縮物稀釋至所要的濃度。

為試驗保護性活性，以所述施用率，對幼年水稻植物噴灑活性化合物配製劑。經處理一天後，植物被接種上水稻稻熱病菌 (*Pyricularia oryzae*) 的孢子水懸浮液，再將植物置於 25°C 及 100%相對濕度的溫室內。

於接種 5 天後進行評估，0%代表相當於對照組之效力，而 100%代表未見到有被感染現象。

此試驗中，在上述表 I 中根據本發明編號為 2、3、4、9、18、19 及 27 之化合物，在施用 250 ppm 濃度的活性化合物下，具有 80%或更大的效力。

實例 H

立枯絲核菌(*Rhizoctonia*)試驗 (水稻)/保護性

溶劑: 28.5 份重的丙酮

乳化劑: 1.5 份重的烷基芳基聚甘醇醚

為產生一種適合的活性化合物配製劑，將 1 份重的活性化合物與所述量的溶劑混合，以水及所述量的乳化劑將此濃縮物稀釋至所要的濃度。

為試驗保護性活性，以所述施用率，對幼年水稻植物噴灑活性化合物配製劑。經處理一天後，植物被接種上立枯絲核菌(*Rhizoctonia solani*)的菌絲，再將植物置於 25°C 及 100%相對濕度的溫室內。

於接種 4 天後進行評估，0%代表相當於對照組之效力，而 100%代表未見到有被感染現象。

此試驗中，在上述表 I 中實例編號為 2、3 及 4 之化合物，在施用 250 ppm 濃度的活性化合物下，具有 80%或更大的效力。

實例 I

葉枯病菌(*Cochliobolus*)試驗 (水稻)/保護性

溶劑: 28.5 份重的丙酮

乳化劑: 1.5 份重的烷基芳基聚甘醇醚

為產生一種適合的活性化合物配製劑，將 1 份重的活性化合物與所述量的溶劑混合，以水及所述量的乳化劑將此濃縮物稀釋至所要的濃度。

為試驗保護性活性，以所述施用率，對幼年水稻植物噴灑活性

化合物配製劑。經處理一天後，植物被接種上稻胡麻葉枯病菌 (*Cochliobolus miyabeanus*) 的孢子水懸浮液，再將植物置於 25°C 及 100% 相對濕度的溫室內。

於接種 4 天後進行評估，0% 代表相當於對照組之效力，而 100% 代表未見到有被感染現象。

此試驗中，在上述表 I 中編號為 2、3、4 及 18 之化合物，在施用 250 ppm 濃度的活性化合物下，具有 80% 或更大的效力。

實例 J

赤黴菌(*Gibberella*)試驗 (水稻)/保護性

溶劑: 28.5 份重的丙酮

乳化劑: 1.5 份重的烷基芳基聚甘醇醚

為產生一種適合的活性化合物配製劑，將 1 份重的活性化合物與所述量的溶劑混合，以水及所述量的乳化劑將此濃縮物稀釋至所要的濃度。

為試驗保護性活性，以所述施用率，對幼年水稻植物噴灑活性化合物配製劑。經處理一天後，植物被接種上云米赤黴病菌 (*Gibberella zeae*) 的孢子水懸浮液，再將植物置於 25°C 及 100% 相對濕度的溫室內。

於接種 5 天後進行評估，0% 代表相當於對照組之效力，而 100% 代表未見到有被感染現象。

此試驗中，在上述表 I 中編號為 2 之化合物，在施用 250 ppm 濃度的活性化合物下，具有 80% 或更大的效力。

實例 K**由蕙蘭細斑病菌(*Fusarium proliferatum*)製備伏馬鏟孢毒素
(Fumonisin FB1)**

被使用的方法係被改造適合微滴定板者，原方法被披露於：
Lopez-Errasquin et al.: Journal of Microbiological Methods 68 (2007)
312-317。

誘發伏馬鏟孢毒素(Fumonisin)的液體培養基(Jiménez et al., Int. J. Food Microbiol. (2003), 89, 185-193)被與濃縮的蕙蘭細斑病菌(*Fusarium proliferatum*)之孢子懸浮液(350 000 孢子/毫升, 被儲存在-160°C下)一起培育至最後的濃度為2000 孢子/毫升。

將化合物溶解(10 mM, 在100% DMSO內)並以H₂O予以稀釋至100 µM。化合物在範圍為自50 µM至0.01 µM 之七種濃度下被測試(由100 µM 的儲備液開始，被稀釋於10% DMSO中)。

取經稀釋的溶液5 µl 與95 µl的培養基於96-孔的微滴定板內混合。將板子蓋住，於20°C下培養6天。

在開始及6天後，進行OD測定 (OD₆₂₀，每孔經多次讀取(平方: 3 x 3))用於計算“pI50”生長。

6天後，取出液體培養基之樣品，稀釋於10% 乙腈，在稀釋液中的樣品中之FB1濃度，利用HPLC-MS/MS分析，所得結果被用於計算“pI50 FB1”值。

HPLC-MS/MS係使用下述參數進行測定:

質譜儀器: Applied Biosystems API4000 QTrap

HPLC: Agilent 1100

自動取樣機: CTC HTS PAL

層析管柱: Waters Atlantis T3 (50x2毫米)

測量的 pI50 值的實例

蕙蘭細斑病菌(*Fusarium proliferatum*)產生的伏馬鐮孢毒素 FB1

來自表 I 之 實例編號	pI50 Fum	pI50 生 長
1	6.4	5.8
2	6.6	5.8
3	6.2	5.8
4	6.6	6.3
5	5.3	4.4
6	5.9	5.6
7	6.4	5.7
8	5.7	5.1
9	6.0	5.5
12	6.6	5.6

實例 L

由禾穀鐮刀菌(*Fusarium graminearum*)產生 DON/乙醯基-DON

化合物在微滴定板內進行試驗，利用七種自 0.07 μM 至 50 μM 的濃度，於一種 DON-誘發的液體培養基 (每升中含有 1 克的 $(\text{NH}_4)_2\text{HPO}_4$ 、0.2 克的 $\text{MgSO}_4 \times 7 \text{H}_2\text{O}$ 、3 克的 KH_2PO_4 、10 克的甘油、5 克的 NaCl 及 40 克的蔗糖) 與燕麥萃出物 (10%) 及 DMSO (0.5%) 內進行。接種係使用一種濃縮的 *Fusarium graminearum* 的孢子懸浮液，最後濃度為 2000 孢子/毫升。

板子被培養在 28°C 下之高空氣濕度下經 7 天。

在開始及 3 天後，在 OD520 下進行 OD 測定 (反復的測量: 3 x 3/每孔) 用於計算生長抑制作用。

7 天後，加入 100 微升的 84/16 之乙腈/水之混合液，然後由各孔取

出液體培養基之樣品，並被稀釋 1:100 於10% 乙腈內。樣品內之DON與乙醯基-DON的比例，藉由HPLC-MS/MS被分析，測得的數值，相較於不含活性化合物之對照組，被用於計算DON/AcDON產生的抑制作用。

HPLC-MS/MS測量係使用下述參數進行:

離子化類型: ESI 負模式

離子噴灑電壓: -4500 V

噴灑氣體溫度: 500°C

脫叢集電位(Decluster potential): -40 V

碰撞能量: -22 eV

碰撞氣體: N₂

NMR 追蹤: 355.0 > 264.9;

HPLC 管柱: Waters Atlantis T3 (三官能的C18束縛, capped)

粒子大小: 3 微米

管柱直徑: 50 x 2 毫米

溫度: 40°C

溶劑 A: 水/2.5 mM NH₄OAc + 0.05% CH₃COOH (v/v)

溶劑 B: 甲醇/2.5 mM NH₄OAc + 0.05% CH₃COOH (v/v)

流速: 400 微升/分鐘

注射體積: 11 微升

梯度:

時間 [分鐘]	A%	B%
0	100	0
0.75	100	0
1.5	5	95
4	5	95
5	100	0
10	100	0

DON抑制作用之實例

實例 5及 9 在50 μM 下，顯現抑制DON/AcDON 方面，具有 > 80%之活性。這些實例對於*Fusarium graminearum* 的生長抑制，在50 μM 下，具有自80至100%之大於80% 的活性。

發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※ 申請案號： 98129480

CO1D 49/12 (2006.01)

※ 申請日： 98.9.2

※IPC 分類：

A01N 43/54 (2006.01)

A01P 3/00 (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

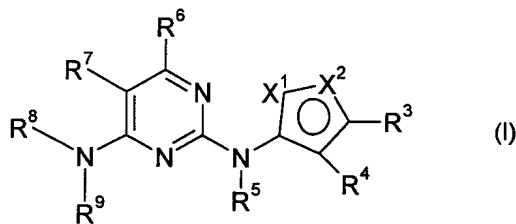
用作殺真菌劑之噻吩基胺基嘧啶

CO1D 239/42 (2006.01)

THIENYLAMINOPYRIMIDINES AS FUNGICIDES

二、中文發明摘要：

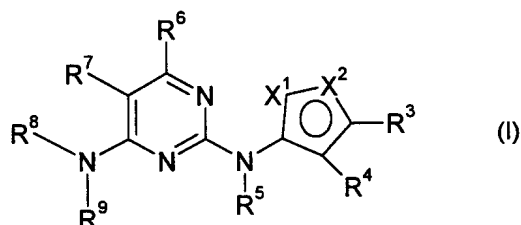
式(I)之噻吩基胺基嘧啶



其中 R^1 至 R^{10} 與 X^1 及 X^2 具有在說明書內所給定義，以及其農業化學上之活性鹽類、其用於控制在植物內及/或植物上，或是在植物的種子內或種子上的植物病原性有害真菌的用途及方法及組成物。也關於製備這樣的組成物及處理的種子之方法且也關於其用於控制在農業、園藝及林業、材料的保護及家居及衛生領域中的植物病原性有害真菌的用途。本發明也關於製備式(I)之噻吩基胺基嘧啶之方法。

三、英文發明摘要：

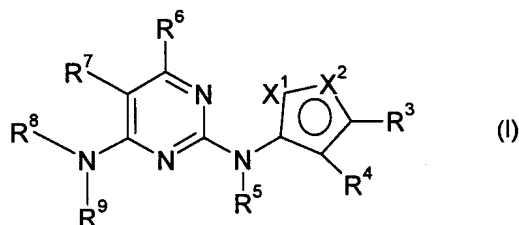
Thienylaminopyrimidines of the formula (I)



in which R1 to R10 and X1 and X2 have the meanings given in the description, and agrochemically active salts thereof, their use and also methods and compositions for controlling phytopathogenic harmful fungi in and/or on plants or in and/or on seed of plants, processes for preparing such compositions and treated seed and also their use for controlling phytopathogenic harmful fungi in agriculture, horticulture and forestry, in the protection of materials and in the domestic and hygiene field. The present invention furthermore relates to a process for preparing thienylaminopyrimidines of the formula (I).

七、申請專利範圍：

1. 一種式(I)的化合物



其中一或多個符號具有如下定義之一：

X^1 代表硫或 CR^1 ，

其中恰好地 X^1 及 X^2 基之一代表硫原子，

R^1 代表氫、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基或鹵素，

如果 X^2 代表 CR^2 ，

R^2 及 R^3 彼此獨立地代表氫、鹵素、CN、硝基、 OR^{10} 、

$O(CH_2)_mOR^{10}$ 、 $O[C(R^{10})_2]_mOR^{10}$ 、 $O[C(R^{10})_2]_mN(R^{10})_2$ 、

$OCOR^{11}$ 、 SR^{10} 、 SOR^{10} 、 SO_2R^{10} 、 $C=OR^{10}$ 、 $CH=NOR^{10}$ 、

$CR^{11}=NOR^{10}$ 、 $COCl$ 、 $CON(R^{10})_2$ 、 $COOR^{10}$ 、 $NR^{10}COR^{10}$ 、

$N(R^{10})_2$ 、 $[C(R^{10})_2]_mCN$ 、 $(CH_2)_mOR^{10}$ 、 $(CH_2)_mSR^{10}$ 、

$[C(R^{10})_2]_mSR^{10}$ 、 $(CH_2)_mSOR^{10}$ 、 $(CH_2)_mSO_2R^{10}$ 、 $(CH_2)_mN(R^{10})_2$ 、

$[C(R^{10})_2]_mN(R^{10})_2$ 、 $(CH_2)_mCOR^{10}$ 、 $[C(R^{10})_2]_mOR^{10}$ 、

$[C(R^{10})_2]_mCOR^{10}$ 、無取代的或經取代的 C_1 - C_8 -烷基、 C_2 - C_6 -烯基

或 C_1 - C_8 -鹵基烷基；其中 $m = 1-4$ ，

其中取代基彼此獨立地為挑選自包括下述基：

氫、氟、氯或溴、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、羥基、氧代基、

C_1 - C_4 -鹵基烷基及氰基，

其中，如果 X^2 代表硫原子，上述的定義僅適用於 R^3 ，

R^4 代表氫、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基或鹵素，

R⁵ 代表氫、C₁-C₂-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-三烷基矽烷基、C₁-C₄-三烷基矽烷基乙基、C₁-C₄-二烷基單苯基矽烷基、CHO、(C₁-C₄-烷基)羰基、(C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基)羰基、(C₃-C₆-烯基氧)羰基、(C₃-C₆-環烷基)羰基、(鹵基-C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基)羰基、(C₁-C₄-鹵基烷基)羰基、(C₁-C₄-烷氧基)羰基、(C₁-C₄-鹵基烷氧基)羰基、苯甲基氧羰基、無取代的或經取代的苯甲基、無取代的或經取代的 C₂-C₆-烯基、無取代的或經取代的 C₂-C₆-炔基、C₁-C₂-烷基亞磺醯基或 C₁-C₂-烷基磺醯基，

其中取代基彼此獨立地為挑選自包括下述基：

氫、鹵素、硝基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、羥基、C₁-C₄-鹵基烷基或氰基，

R⁶ 代表氫、C₁-C₃-烷基、氰基或 C₁-C₃-鹵基烷基，

R⁷ 代表鹵素、氰基、C₁-C₃-烷基、C₁-C₃-鹵基烷基、C₁-C₃-鹵基烷氧基、SMe、SOMe 或 SO₂Me，

R⁸ 代表氫、C₁-C₂-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₆-tri 烷基矽烷基、C₁-C₄-tri 烷基矽烷基乙基、C₁-C₄-二烷基單苯基矽烷基、(C₁-C₄-烷基)羰基、(C₁-C₄-鹵基烷基)羰基、(C₁-C₄-烷氧基)羰基、無取代的或經取代的苯甲基、無取代的或經取代的 C₂-C₆-烯基、無取代的或經取代的 C₂-C₆-炔基、C₁-C₆-烷基亞磺醯基、C₁-C₆-烷基磺醯基、C₁-C₆-鹵基烷基亞磺醯基或 C₁-C₆-鹵基烷基磺醯基，

其中取代基彼此獨立地為挑選自包括下述基：

氟、氯及溴原子、氰基、羥基、甲氧基及 CF₃，

R^9 代表直鏈或分枝的無取代的或經取代的 C_1 - C_7 -烷基、直鏈或分枝的無取代的或經取代的 C_2 - C_7 -鹵基烷基、無取代的或經取代的 C_3 - C_7 -環烷基、直鏈或分枝的無取代的或經取代的 C_3 - C_7 -環烷基- C_1 - C_3 -烷基、直鏈或分枝的無取代的或經取代的 C_3 - C_7 -烯基、直鏈或分枝的無取代的或經取代的 C_3 - C_7 -炔基、直鏈或分枝的無取代的或經取代的 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、直鏈或分枝的無取代的或經取代的 C_1 - C_4 -鹵基烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、2-甲基-1-(甲基硫烷基)丙烷-2-基或氧雜環丁烷-3-基，

或

R^8 及 R^9 一起與其附接的氮原子形成一種無取代的或經取代的 3-至 7-成員的飽和的環，其可能含有另外達 1 個挑選自包括氧、硫及氮的雜原子，

R^{10} 為相同或相異的且代表氫、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -鹵基烷基、無取代的或經取代的 C_3 - C_6 -環烷基、 C_1 - C_4 -三烷基矽烷基、無取代的或經取代的 C_2 - C_4 -烯基、無取代的或經取代的 C_2 - C_4 -炔基、無取代的或經取代的 苯基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷基硫- C_1 - C_4 -烷基、無取代的或經取代的苯甲基或一種 3-至 7-成員的 無取代的或經取代的，飽和的或不飽和的，可能不含有或含有達 4 個挑選自包括 N、O 及 S 的雜原子之環，其中兩個氧原子不為相鄰，

或，

如果兩個 R^{10} 基為被附接至一個氮原子，兩個 R^{10} 基可形成一種 3-至 7-成員的無取代的或經取代的飽和的或不飽和的，可能另外含有達 4 個挑選自包括 N、O 及 S 的雜原子之環，其中兩個氧原子不

為相鄰，

或

如果兩個 R^{10} 為相鄰成 $NR^{10}COR^{10}$ 基時，兩個 R^{10} 基可形成一種 3-至 7-成員的無取代的或經取代的，飽和的或不飽和的，可能另外含有達 4 個挑選自包括 N、O 及 S 的雜原子之環，其中兩個氧原子不為相鄰，

R^{11} 為相同或相異且代表 C_1 - C_8 -烷基、 C_1 - C_8 -鹵基烷基、 C_1 - C_4 -三烷基矽烷基、無取代的或經取代的 C_2 - C_6 -烯基、無取代的或經取代的 C_2 - C_6 -炔基、無取代的或經取代的 C_3 - C_6 -環烷基、無取代的或經取代的芳基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、無取代的或經取代的苯甲基或 3- to 7-成員的無取代的或經取代的飽和的或不飽和的，可能不含有或含有達 4 個挑選自包括 N、O 及 S 的雜原子之環，其中兩個氧原子不為相鄰，

其中在 R^{10} 中之取代基彼此獨立地為挑選自包括下述基：

甲基、乙基、異丙基、環丙基、氟、氯及溴原子、甲氧基、乙氧基、甲基氫硫基、乙基氫硫基、氰基、羥基及 CF_3 ，

以及其農業化學上之活性鹽類。

2. 一種式(I)的化合物，其中一或多個符號具有下述定義之一：

X^1 代表硫或 CR^1 ，

X^2 代表硫或 CR^2 ，

其中恰好地 X^1 及 X^2 基之一代表硫原子，

R^1 代表氫、甲基、甲氧基或 Cl，

如果 X^2 代表 CR^2 ，

R^2 及 R^3 彼此獨立地代表氫、鹵素、CN、硝基、羥基、O-C₁-C₄-烷基、O-(C₁-C₃-鹵基烷基)、O-(C₃-C₆-環烷基)、O-C₂-C₄-烯基、O-C₂-C₄-炔基、O(CH₂)_mO(C₁-C₄-烷基)、OPh、OCO(C₁-C₄-烷基)、SH、S-C₁-C₄-烷基、S-C₁-C₃-鹵基烷基、SPh、SO(C₁-C₄-烷基)、SO₂(C₁-C₄-烷基)、SO₂(C₁-C₃-鹵基烷基)、SO₂(C₂-C₄-烯基)、SO₂(C₂-C₄-炔基)、CHO、CO(C₁-C₄-烷基)、CH=NO(C₁-C₄-烷基)、C(C₁-C₄-烷基)=NO(C₁-C₄-烷基)、CONH(C₁-C₄-烷基)、CON(C₁-C₄-烷基)₂、CON(SiMe₃)₂、CONH(C₁-C₃-鹵基烷基)、CONH(C₂-C₄-烯基)、CONH(C₂-C₄-炔基)、CONH(C₃-C₆-環烷基)、CONHCH₂C(=CH₂)CH₃、CONHCH(CH₃)CH₂O(C₁-C₄-烷基)、CONH(CH₂)_mO(C₁-C₄-烷基)、CONH(CH₂)_mS(C₁-C₄-烷基)、CONHCH(CH₃)CH₂S(C₁-C₄-烷基)、CONHPh、吡咯啉-1-基羰基、六氫吡啶-1-基羰基、(4-甲基六氫吡啶-1-基)羰基、雜氮環丁烷-1-基羰基、氮丙啶-1-基羰基、六亞甲基亞胺-1-基-羰基、嗎啉-1-基羰基、硫嗎啉-1-基羰基、COOH、COCl、(C₁-C₄-烷氧基)羰基、NHCO(C₁-C₄-烷基)、NHCO(C₁-C₄-鹵基烷基)、N(C₁-C₂-烷基)CO(C₁-C₄-烷基)、NHCO(C₂-C₄-烯基)、NHCOPh、NHCO(C=CH₂)CH₃、NHCON(C₁-C₄-烷基)₂、NHCO(CH₂)_mO(C₁-C₄-烷基)、NHCHO、N(C₁-C₄-烷基)CHO、NH₂、NH(C₁-C₄-烷基)、N(C₁-C₄-烷基)₂、NHCH(C₁-C₄-烷基)CH₂O(C₁-C₄-烷基)、(CH₂)_mCN、(CH₂)_mSO(C₁-C₄-烷基)、(CH₂)_mSO₂(C₁-C₄-烷基)、(CH₂)_mCO(C₁-C₄-烷基)、(CH₂)_mO(C₁-C₄-烷基)、C(CH₃)₂O(C₁-C₄-烷基)、(CH₂)_mC(C₁-C₄-烷基)₂O(C₁-C₄-烷基)、CH₂OH、(CH₂)_mS(C₁-C₄-烷基)、C(CH₃)₂S(C₁-C₄-烷基)、(CH₂)_mNH(C₁-C₄-

烷基)、 $(\text{CH}_2)_m\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})_2$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-環烷基}$ 或 $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-鹵基烷基}$ ，

其中，如果 X^2 代表硫原子，上述的定義僅適用於 R^3 且 $m = 1 - 4$ ，

R^4 代表氫、甲基、甲氧基、氯或氟，

R^5 代表氫、Me、COMe、CHO、 $\text{COCH}_2\text{OCH}_3$ 、 CH_2OCH_3 、

COOMe、COOEt、COO*tert*Bu、COOBn、 COCF_3 、

$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 SOCH_3 、 SO_2CH_3 或苯甲基，

● R^6 代表氫、氰基、甲基、 CF_3 或 CFH_2 ，

R^7 代表氟、氯、溴、碘、甲基、 OCF_3 或 CF_3 ，

R^8 代表氫、甲基、乙基、丙基、丙-2-基、2-甲氧基乙-1-基、丙-2-

烯-1-基、 CH_2OCH_3 、COH、COMe、COOMe、COOEt、

COO*tert*Bu、 COCF_3 或苯甲基，

R^9 代表直鏈或分枝的無取代的或經取代的 $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-烷基}$ 、無取代的

或經取代的 $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-環烷基}$ 、直鏈或分枝的無取代的或經取代的

$\text{C}_3\text{-C}_6\text{-環烷基-C}_1\text{-C}_2\text{-烷基}$ 、無取代的或經取代的 $\text{C}_2\text{-C}_5\text{-鹵基烷}$

基、直鏈或分枝的無取代的或經取代的 $\text{C}_3\text{-C}_5\text{-烯基}$ 或2-甲基-1-

(甲基硫烷基)丙烷-2-基，

其中在 R^9 中的取代基彼此獨立地為挑選自包括下述基：甲基、乙

基、異丙基、環丙基、氟、氯及溴原子、甲氧基、乙氧基、甲基氫硫

基、乙基氫硫基、氰基、羥基及 CF_3 ，

以及其農業化學上之活性鹽類。

3. 一種式(I)之化合物，其中一或多個符號具有下述含義之一：

X^1 代表硫或 CR^1 ，

X^2 代表硫或 CR^2 ,

其中恰好地 X^1 及 X^2 基之一為硫原子 ,

R^1 代表氫 ,

如果 X^2 代表 CR^2 ,

R^2 及 R^3 彼此獨立地代表氫、COOMe、COOEt、COOPr、COO*i*Pr、

CONH(C₄H₉)、CONH(CH₂)₂OMe、CONHCH(CH₃)CH₂OMe、

CONHOH、CONHMe、CONHEt、CONHPr、CONH*i*Pr、

CONH(*i*-C₄H₉)、CONHPh、CONH(CH₂)₂SCH₃、

CONHCH(CH₃)CH₂SCH₃、CONHCH₂CF₃、

CONHCH₂CH=CH₂、CONHCH₂C≡CH、CONMeCH₂C≡CH、

CONHCH₂C(=CH₂)CH₃、CONHPh、CONH 環丙基、

CON(Me)*i*C₃H₇、CON(Me)CH₂CH=CH₂、CON(Et)₂、CON(Me)

環丙基甲基、CON(Me)環丁基甲基、CON(Ph)₂、CON(Me)₂、

CON(Pr)₂、吡咯啉-1-基羰基、六氫吡啶-1-基羰基、(4-甲基六氫

吡啶-1-基)羰基、雜氮環丁烷-1-基羰基、氮丙啶-1-基-羰基、六

亞甲基亞胺-1-基羰基、嗎啉-1-基羰基、硫嗎啉-1-基羰基、

CON(SiMe₃)₂、COMe、COEt、COPr、CN、C(=NOCH₃)Me、

C(=NOEt)Me、C(=NOPr)Me、氯、溴、碘、硝基、SH、SMe、

SEt、SPr、SCF₃、SPh、COOH、Me、Et、Pr、SO₂Me、SO₂Et、

CH₂OMe 或 CH₂OEt ,

其中 , 如果 X^2 代表硫原子時 , 上述的定義僅適用於 R^3 ,

R^4 代表氫 ,

R^5 代表氫、COMe、CHO、CH₂OCH₃、COOMe 或 CH₂C≡CH ,

R^6 代表氫 ,

R^7 代表氟、氯、溴、碘、 OCF_3 或 CF_3 ，

R^8 代表氫或甲基，

R^9 代表環丙基、環丁基、2-甲基環丙-1-基、2-甲基環丁-1-基、3-甲基環丁-1-基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、異丙基、環丙基甲基、甲基、乙基、2,2-二甲基環丙基、環戊基、丙-2-基、丙-2-烯-1-基、丁-2-基、1-甲氧基丙-2-基、2-甲基-1-(甲基硫烷基)丙-2-基、氧雜環丁烷-3-基、1,1,1-三氟丙烷-2-基或 2,2,3,3,3-五氟丙基、

以及其農業化學上之活性鹽類。

4. 一種式(I)的化合物，其中一或多個符號具有下述含義之一：

X^1 代表硫或 CR^1 ，

X^2 代表硫或 CR^2 ，

其中恰好的， X^1 及 X^2 基之一代表一個硫原子，

R^1 代表氫，

如果 X^2 代表 CR^2 ，

R^2 及 R^3 彼此獨立地代表氫、 CH_3 、 $COOMe$ 、 $CONH(tert-C_4H_9)$ 、

$CONH(CH_2)_2OMe$ 、 $CONHCH(CH_3)CH_2OMe$ 、 $CONHOH$ 、

$CON(Me)iC_3H_7$ 、 $CON(Me)CH_2CH=CH_2$ 、 $CON(Et)_2$ 、 CON 甲基

環丙基甲基、吡咯啉-1-基羰基、六氫吡啶-1-基羰基、嗎啉-1-基

羰基、 $COMe$ 、 CN 、 $C(=NOCH_3)CH_3$ 、氯、溴、 SMe 、

$CONHCH_2CF_3$ 、 $CONHCH_2CH=CH_2$ 、 $CONHCH_2C\equiv CH$ 、

$CONMeCH_2C\equiv CH$ 、 $CONHCH_2C(=CH_2)CH_3$ 、 $CONHPh$ 、

$CONH$ 環丙基、(4-甲基六氫吡啶-1-基)羰基、 $COOH$ 或

SO₂Me,

其中，如果 X² 代表硫原子，上述的定義僅適用於 R³，

R⁴ 代表氫，

R⁵ 代表氫，

R⁶ 代表氫，

R⁷ 代表氯、溴、或 CF₃，

R⁸ 代表氫，

R⁹ 代表環丙基、環丁基、2-甲基環丙-1-基、2-甲基環丁-1-基、3-甲基環丁-1-基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、異丙基或環丙基甲基，

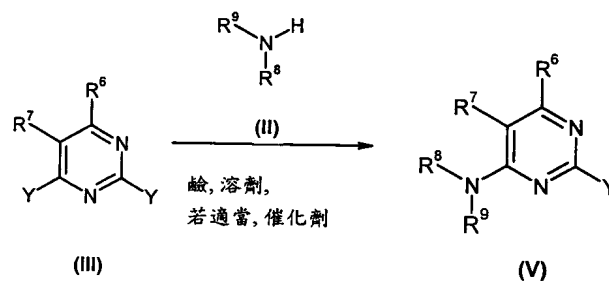
以及其農業化學上之活性鹽類。

5. 一種用於控制植物病原性有害的真菌之組成物，特徵在於其除了包含展延劑及/或界面活性劑外，尚包含至少一種根據申請專利範圍第 1 至 4 項中一或多項之式(I)的噻吩基胺基嘧啶。
6. 一種使用根據申請專利範圍第 1 至 4 項中一或多項之式(I)的噻吩基胺基嘧啶於控制植物病原性有害的真菌之用途。
7. 一種用於控制植物病原性有害的真菌之方法，特徵在於施用根據申請專利範圍第 1 至 4 項中一或多項之式(I)的噻吩基胺基嘧啶至植物病原性有害的真菌及/或其居住環境。
8. 一種製備用於控制植物病原性有害的真菌之組成物的方法，特

微在於將根據申請專利範圍第 1 至 4 項中一或多項之式(I)的噻吩基胺基嘧啶與展延劑及/或界面活性劑混合。

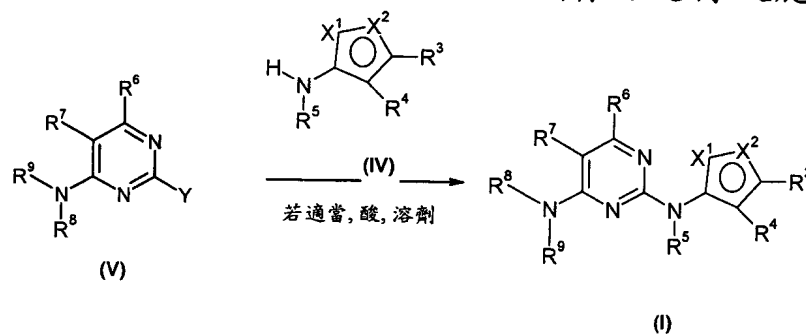
9. 一種用於製備根據本發明的式(I)之噻吩基胺基嘧啶的方法，包含至少一個下面(a)至(e)之步驟：

(a) 根據下面的反應圖示，令式(III)的 2,4-二鹵基嘧啶與式(II)的胺，在鹼存在下，若適當地，於一溶劑內，若適當，在催化劑存在下反應，製得式(V)的化合物：



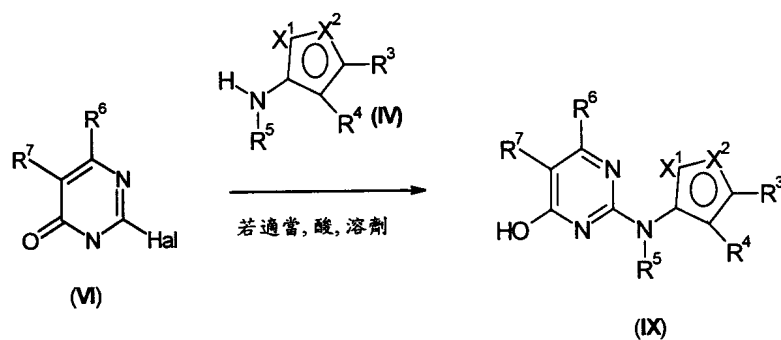
其中 Y = F、Cl、Br、I

(b) 根據下面的反應圖示，令式(V)的化合物與式(IV)的胺基噻吩，若適當，在酸存在下，若適當，於溶劑內進行反應：



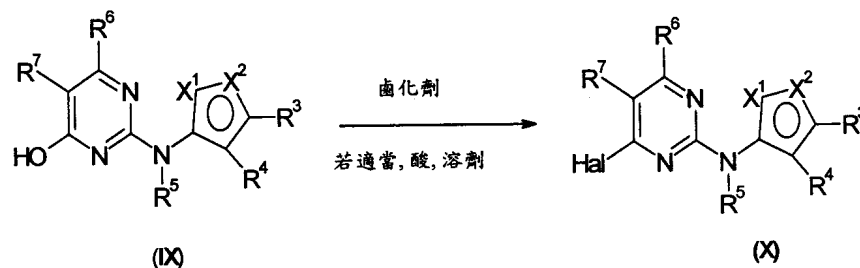
其中 Y = F、Cl、Br、I

(c) 根據下面的反應圖示，令式(VI)的化合物與式(IV)的胺基噻吩，若適當，在酸存在下及於溶劑內進行反應：

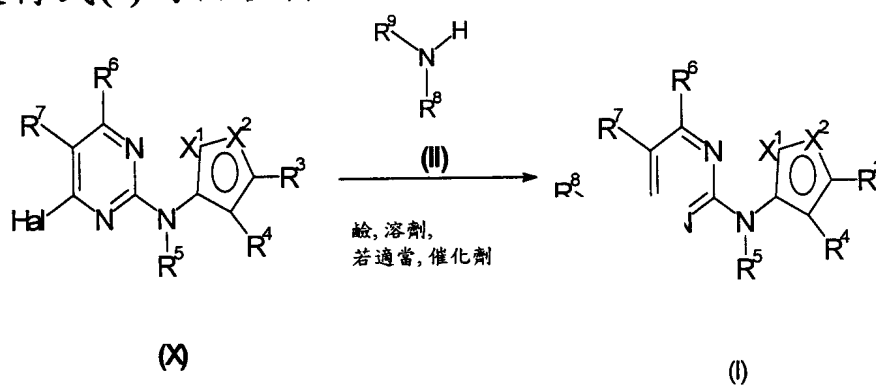


其中 Hal = F、Cl、Br、I

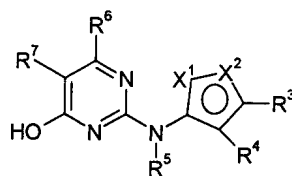
- (d) 根據下面反應圖示，令式(IX)的化合物與鹵化劑，若適當，於溶劑內進行反應，製得式(X)的化合物：



- (e) 根據下面反應圖示，令式(X)的化合物與式(II)的胺類，在鹼存在下，若適當，於一種溶劑內，若適當，在催化劑存在下進行反應，製得式(I)的化合物：



10. 一種式(IX)之化合物

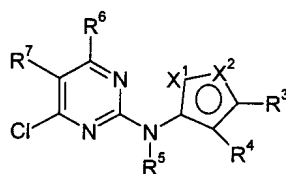


(IX)

其中符號具有下述含義：

X^1 、 X^2 、 R^1 至 R^6 、 R^7 相當於根據申請專利範圍第 1 項之定義。

11. 一種式(X)之化合物

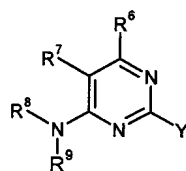


(X)

其中符號具有下述含義：

X^1 、 X^2 、 R^1 至 R^7 相當於根據申請專利範圍第 1 項之定義。

12. 一種式(V)的化合物



(V)

其中符號具有下述含義：

R^6 代表氫，

且，如果

R^7 代表 I、SMe、SOMe、SO₂Me、CF₃、CFH₂ 或 CF₂H，且

Y 代表 F、Cl、Br 或 I，

R^8 代表氫、乙基、丙基、丙-2-基、2-甲氧基乙烷-1-基、丙-2-烯-1-基、CH₂OCH₃、COMe、COOMe、COOEt、COO^{tert}Bu、

COCF_3 苯甲基，且

R^9 代表環丙基、環丁基、2-甲基環丙-1-基、2-甲基環丁-1-基、3-甲基環丁-1-基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、異丙基、環丙基甲基、甲基、乙基、2,2-二甲基環丙基、環戊基、丙-2-基、丙-2-烯-1-基、丁-2-基、1-甲氧基丙-2-基、2-甲基-1-(甲基硫烷基)丙-2-基、1,1,1-三氟丙烷-2-基或 2,2,3,3,3-五氟丙基，

且，如果

R^7 代表氰基，且

Y 代表 F、Cl、Br 或 I，

R^8 代表氫、甲基、丙基、丙-2-基、2-甲氧基乙烷-1-基、丙-2-烯-1-基、 CH_2OCH_3 、 COMe 、 COOMe 、 COOEt 、 COOtertBu 、

COCF_3 或苯甲基且

R^9 代表環丁基、2-甲基環丙-1-基、2-甲基環丁-1-基、3-甲基環丁-1-基、2,2-二氟乙基、異丙基、環丙基甲基、2,2-二甲基環丙基、環戊基、丁-2-基、1-甲氧基丙-2-基、2-甲基-1-(甲基硫烷基)丙-2-基、1,1,1-三氟丙烷-2-基或 2,2,3,3,3-五氟丙基。

四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第（無）圖。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：無

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

