



(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 201206351 A1

(43)公開日：中華民國 101 (2012) 年 02 月 16 日

(21)申請案號：100118393

(22)申請日：中華民國 100 (2011) 年 05 月 26 日

(51)Int. Cl. : *A01N43/78 (2006.01)*
A01P21/00 (2006.01)

A01P3/00 (2006.01)

(30)優先權：2010/05/27 歐洲專利局
2010/06/02 美國

10164141.3
61/350,514

(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：倪信恩 卡爾 NISING, CARL FRIEDRICH (DE)；漢姆克 亨德里克 HELMKE,
HENDRIK (DE)；克里斯多 皮埃爾 CRISTAU, PIERRE (FR)；佩里斯 戈爾卡
PERIS, GORKA (ES)；土屋知己 TSUCHIYA, TOMOKI (JP)；瓦奈爾 皮埃爾
WASNAIRE, PIERRE (BE)；伯汀 于爾根 BENTING, JUERGEN (DE)；達門 彼
特 DAHMEN, PETER (DE)；沃森道夫 諾伊曼 烏爾麗克 WACHENDORFF-
NEUMANN, ULRIKE (DE)

(74)代理人：黃慶源；陳彥希

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：11 項 圖式數：0 共 83 頁

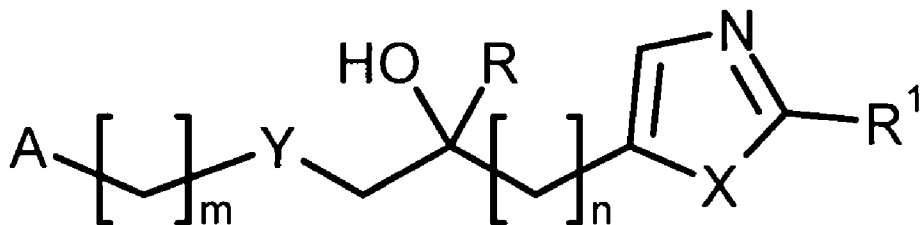
(54)名稱

新穎雜環烷醇衍生物

NOVEL HETEROCYCLIC ALKANOL DERIVATIVES

(57)摘要

本發明係關於新穎之雜環烷醇衍生物，關於製備此等化合物的方法，關於包含此等化合物之組成物，及關於其等作為生物活性化合物之用途，特別於作物保護中及於物質保護中用來控制有害的微生物且作為植物生長調節劑。





(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 201206351 A1

(43)公開日：中華民國 101 (2012) 年 02 月 16 日

- (21)申請案號：100118393 (22)申請日：中華民國 100 (2011) 年 05 月 26 日
- (51)Int. Cl. : *A01N43/78 (2006.01)* *A01P3/00 (2006.01)*
A01P21/00 (2006.01)
- (30)優先權：2010/05/27 歐洲專利局 10164141.3
2010/06/02 美國 61/350,514
- (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：倪信恩 卡爾 NISING, CARL FRIEDRICH (DE)；漢姆克 亨德里克 HELMKE,
HENDRIK (DE)；克里斯多 皮埃爾 CRISTAU, PIERRE (FR)；佩里斯 戈爾卡
PERIS, GORKA (ES)；土屋知己 TSUCHIYA, TOMOKI (JP)；瓦奈爾 皮埃爾
WASNAIRE, PIERRE (BE)；伯汀 于爾根 BENTING, JUERGEN (DE)；達門 彼
特 DAHMEN, PETER (DE)；沃森道夫 諾伊曼 烏爾麗克 WACHENDORFF-
NEUMANN, ULRIKE (DE)
- (74)代理人：黃慶源；陳彥希
- 申請實體審查：無 申請專利範圍項數：11 項 圖式數：0 共 83 頁

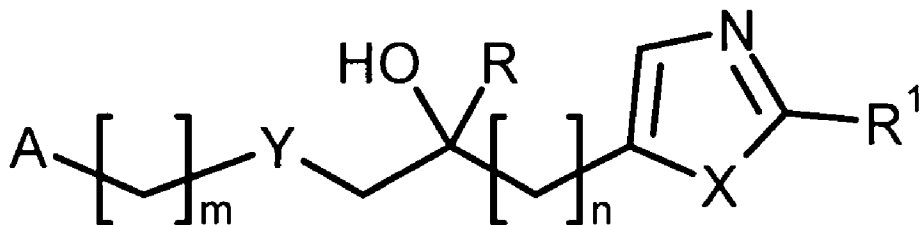
(54)名稱

新穎雜環烷醇衍生物

NOVEL HETEROCYCLIC ALKANOL DERIVATIVES

(57)摘要

本發明係關於新穎之雜環烷醇衍生物，關於製備此等化合物的方法，關於包含此等化合物之組成物，及關於其等作為生物活性化合物之用途，特別於作物保護中及於物質保護中用來控制有害的微生物且作為植物生長調節劑。



- Y 為 O、-CH₂-或直接鍵，
- m 為 0 或 1，
- n 為 0 或 1，
- R 於各情況中為任意經取代之烷基、烯基、環烷基或芳基，
- R¹ 為氫、SH、烷基硫基、烷氧基、鹵素、鹵烷基、鹵烷基硫基、鹵烷氧基、氰基、硝基或 Si(烷基)₃，
- A 於各情況中為二-Z-經取代之苯基或萘基，其中二個取代基 Z 為相同或不同，
- Z 為鹵素、氰基、硝基、OH、SH、C(烷基)(=NO 烷基)、C₃-C₇-環烷基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-鹵烷氧基、C₁-C₄-烷基硫基、C₁-C₄-鹵烷基硫基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-鹵烯基、C₂-C₄-炔基、C₂-C₄-鹵炔基、C₁-C₄-烷基亞磺醯基、C₁-C₄-鹵烷基亞磺醯基、C₁-C₄-烷基磺醯基、C₁-C₄-鹵烷基磺醯基、甲醯基、C₂-C₅-烷基羰基、C₂-C₅-鹵烷基羰基、C₂-C₅-烷氧基羰基、C₂-C₅-鹵烷氧基羰基、C₃-C₆-烯基氧基、C₃-C₆-炔基氧基、C₂-C₅-烷基羰基氧基、C₂-C₅-鹵烷基羰基氧基、三烷基矽烷基，或於各情況中任意經鹵素-、C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-鹵烷基-、C₁-C₄-烷氧基-或 C₂-C₄-烷基羰基-單取代之苯基、苯氧基或苯基硫基，
- 及其農化上活性之鹽類。

以此方式可得到之鹽同樣具有殺真菌及/或植物生長調節的特性。

根據本發明可使用之雜環烷醇衍生物係以式(I)之通稱來定義。指明於前文及下文之各式中的較佳基團定義係給定於下。此等定義相等地適用於式(I)之最終產物且適用於所有的中間體上(亦參見如下「製法及中間體之闡明」)。

- X 較佳為 S。
- X 較佳亦為 O。
- Y 較佳為 O。
- Y 較佳亦為 -CH₂-。
- Y 較佳亦為直接鍵。
- Y 更佳為 O。
- Y 更佳亦為 -CH₂-。
- m 較佳為 0。
- m 較佳亦為 1。
- n 較佳為 0。
- n 較佳亦為 1。
- R 於各情況中較佳為任意分支的 C₃-C₇-烷基、C₁-C₈-鹵烷基、C₂-C₇-烯基、C₂-C₇-鹵烯基、任意經鹵素-、C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-鹵烷基-、C₁-C₄-烷氧基-、C₁-C₄-鹵烷氧基-、C₁-C₄-鹵烷基硫基-或 C₁-C₄-烷基硫基-取代之 C₃-C₇-環烷

- 基，及任意經一-至三-鹵素-或-C₁-C₄-烷基-取代之苯基。
- R 於各情況中更佳為任意分支的 C₃-C₅-烷基、C₁-C₆-鹵烷基、C₃-C₅-烯基、C₃-C₅-鹵烯基、任意經鹵素-、C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-鹵烷基-、C₁-C₄-鹵烷氧基-、C₁-C₄-烷氧基-、C₁-C₄-鹵烷基硫基-或 C₁-C₄-烷基硫基-取代之 C₃-C₆-環烷基。
- R 最佳為第三丁基、異丙基、1-氯環丙基、1-氟環丙基、1-甲基環丙基、1-甲氧基環丙基、1-甲基硫基環丙基、1-三氟甲基環丙基、(3E)-4-氯-2-甲基丁-3-烯-2-基、C₁-C₄-鹵烷基。
- R¹ 較佳為氫、SH、C₁-C₄-烷基硫基、C₁-C₄-烷氧基或鹵素。
- R¹ 更佳為氫、SH、甲基硫基、乙基硫基、甲氧基、乙氧基、氟、氯、溴或碘。
- A 較佳為二-Z-經取代之苯基，其中二個取代基 Z 為相同或不同。
- A 更佳為 2-及 4-Z-經取代之苯基，其中二個取代基 Z 為相同或不同。
- A 同樣更佳為 3-及 4-Z-經取代之苯基，其中二個取代基 Z 為相同或不同。
- A 同樣更佳為 3-及 5-Z-經取代之苯基，其中二個取代基 Z 為相同或不同。
- A 較佳為二-Z-經取代之苯基，其中二個取代基 Z 為

相同或不同。

- A 更佳為二-Z-經取代之 1-萘基，其中二個取代基 Z 為相同或不同。
- A 同樣更佳為二-Z-經取代之 2-萘基，其中二個取代基 Z 為相同或不同。
- Z 較佳為鹵素、氰基、硝基、C(C₁-C₅-烷基)(=NO(C₁-C₅-烷基))、C₃-C₆-環烷基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-鹵烷氧基、C₁-C₄-烷基硫基、C₁-C₄-鹵烷基硫基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₁-C₄-烷基亞磺醯基、C₁-C₄-烷基磺醯基、C₂-C₅-烷基羰基、C₂-C₅-烷氧基羰基、C₃-C₆-烯基氧基、C₃-C₆-炔基氧基、C₂-C₅-烷基羰基氧基，或於各情況中任意經鹵素-、C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-鹵烷基-、C₁-C₄-烷氧基-或 C₂-C₄-烷基羰基-單取代之苯基、苯氧基或苯基硫基。
- Z 更佳為鹵素、氰基、硝基、C(C₁-C₄-烷基)(=NO(C₁-C₄-烷基))、C₃-C₆-環烷基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₂-鹵烷基、C₁-C₂-烷氧基、C₁-C₂-鹵烷氧基、C₁-C₂-烷基硫基、C₁-C₂-鹵烷基硫基、C₁-C₂-烷基亞磺醯基、C₁-C₂-烷基磺醯基、乙醯、甲氧基羰基、乙氧基羰基、甲基羰基氧基，或於各情況中任意經鹵素-、C₁-C₂-烷基-、C₁-C₂-鹵烷基-、C₁-C₂-烷氧基-、乙醯-單取代之苯基、苯氧基或苯基硫基。

Z 最佳為氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、CH(=NOMe)、環丙基、環丁基、環戊基、環己基、甲基、乙基、正-丙基、異丙基、正-、異-、第二-或第三-丁基、三氟甲基、三氯甲基、二氟甲基、二氯甲基、二氟氯甲基、甲氧基、三氟甲氧基、二氟甲氧基、甲基硫基、三氟甲基硫基、二氟甲基硫基，或於各情況中任意經氟-、氯-、溴-、碘-、甲基-、乙基-、三氟甲基-、三氯甲基-、二氟甲基-、二氯甲基-、二氟氯甲基-、甲氧基-、乙醯-單取代之苯基、苯氧基或苯基硫基。

然而，以一般名稱給定於前之基團定義及解釋或說明於較佳範圍內者，如果想要，亦可與另一個，亦即包含在特定範圍及較佳範圍中者合併。彼等係適用於最終產物且對應於先質及中間體二者。此外，個別的定義不可適用。

較佳者為那些式(I)化合物，其中各個基團具有上述較佳之定義。

特別較佳者為那些式(I)化合物，其中各個基團具有上述更佳之定義。

非常特別較佳者為那些式(I)化合物，其中各個基團具有上述最佳之定義。

較佳者亦為式(I)化合物，其中 Y 為氧。

較佳者亦為式(I)化合物，其中 Y 為-CH₂-。

較佳者亦為式(I)化合物，其中 Y 為直接鍵。

較佳者亦為式(I)化合物，其中 R 為第三丁基。

較佳者亦為式(I)化合物，其中 R 為 1,3-二氟-2-甲基丙-2-基。

較佳者亦為式(I)化合物，其中 R 為 1-甲基環丙基。

較佳者亦為式(I)化合物，其中 R 為 1-氟環丙基。

較佳者亦為式(I)化合物，其中 R 為 1-氯環丙基。

較佳者亦為式(I)化合物，其中 R 為異丙基。

較佳者亦為式(I)化合物，其中 R 為 1-甲基環己基。

較佳者亦為式(I)化合物，其中 n 為 0。

較佳者亦為式(I)化合物，其中 n 為 1。

較佳者亦為式(I)化合物，其中 X 為硫。

較佳者亦為式(I)化合物，其中 R¹ 為氫。

較佳者亦為式(I)化合物，其中 R¹ 為 SH。

指明於前之基團定義如果想要可與另一個合併。此外，個別的定義不可適用。

於上式所給定之符號定義中，集體名稱一般係代表下列取代基而使用：

鹵素：(亦於例如鹵烷基、鹵烷氧基等之組合)氟、氯、溴及碘；

烷基：(包括於例如烷基硫基、烷氧基等之組合)具有 1 至 8 個碳原子之飽和、直鏈或分支烴基，例如 C₁-C₆-烷基，如甲基、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、辛基。

鹵烷基：(包括於例如鹵烷基硫基、鹵烷氧基等之組合) 具有 1 至 8 個碳原子之直鏈或分支烷基基團(如上所指明)，其中，此等基團中之一些或全部的氫原子可被如上所指明之鹵素原子所替代，例如 C₁-C₃-鹵烷基如氯甲基、溴甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、1-氯乙基、1-溴乙基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基及 1,1,1-三氟丙-2-基。

烯基：具有 2 至 8 個碳原子及一個雙鍵於任何位置上之不飽和、直鏈或分支烴基，例如 C₂-C₆-烯基如乙烯基、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。

環烷基：具有 3 至 8 個碳環元之單環飽和烴基，如環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基及環辛基。

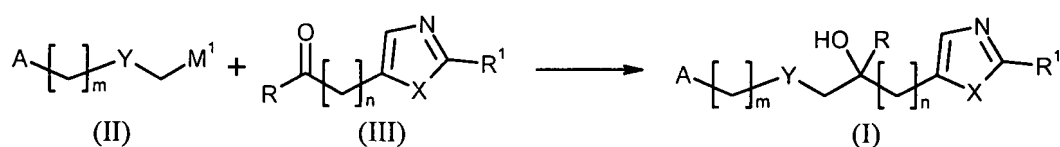
芳基：不飽和或飽和、芳族、單-、二-或三環的環，例如苯基、萘基、蒽基（蒽基 (anthryl)）、菲蒽基 (phenanthracenyl) (菲基)。

雜芳基：含有至多 4 個氮原子或 1 個氮原子及至多 2 個選自 N、O 及 S 之其他雜原子的未經取代或經取代、不飽和之 5-至 7-員雜環：例如 2-呋喃基、3-呋喃基、2-噁吩基、3-噁吩基、2-吡咯基、3-吡咯基、1-吡咯基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡唑基、1-吡唑基、1H-咪唑-2-基、1H-咪唑-4-基、1H-咪唑-5-基、1H-咪唑-1-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、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、1H-1,2,3-三唑-1-基、1H-1,2,3-三唑-4-基、1H-1,2,3-三唑-5-基、2H-1,2,3-三唑-2-基、2H-1,2,3-三唑-4-基、1H-1,2,4-三唑-3-基、1H-1,2,4-三唑-5-基、1H-1,2,4-三唑-1-基、4H-1,2,4-三唑-3-基、4H-1,2,4-三唑-4-基、1H-四唑-1-基、1H-四唑-5-基、2H-四唑-2-基、2H-四唑-5-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、1,3,4-噁二唑-2-基、1,3,4-噻二唑-2-基、1,2,3-噁二唑-4-基、1,2,3-噁二唑-5-基、1,2,3-噻二唑-4-基、1,2,3-噻二唑-5-基、1,2,5-噁二唑-3-基、1,2,5-噻二唑-3-基、2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、3-嗒吡基、4-嗒吡基、

2-嘓啖基、4-嘓啖基、5-嘓啖基、2-吡咩基、1,3,5-三咩-2-基、1,2,4-三咩-3-基、1,2,4-三咩-5-基、1,2,4-三咩-6-基。
製法及中間體之說明

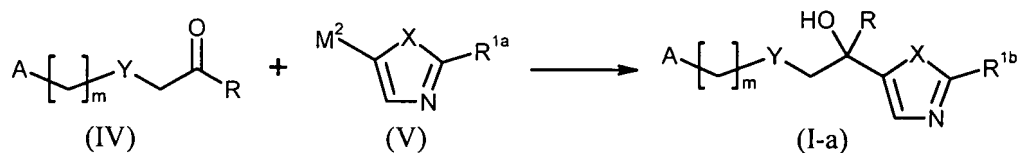
該式(I)雜環烷醇衍生物可用不同的方式製備(參閱 EP-A 0 409 418)。首先，可能的製法係以圖表顯示於下。除非另有說明，所指明之基團係各自定義於前。

圖示 1：製法 A



M¹ 為金屬或金屬鹵化物，例如鋰、鎂(Mg-Hal 其中 Hal = 鹵素)、鈦[Ti(OAlk)₃ 其中 Alk = C₁-C₄-烷基]。

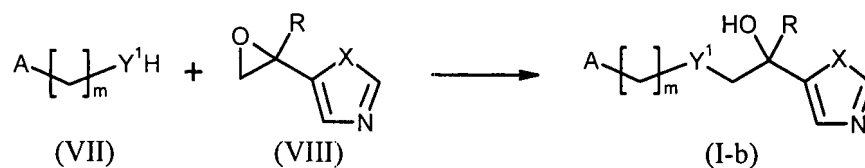
圖示 2：製法 B (n = 0)



M² 為金屬，例如鋰。

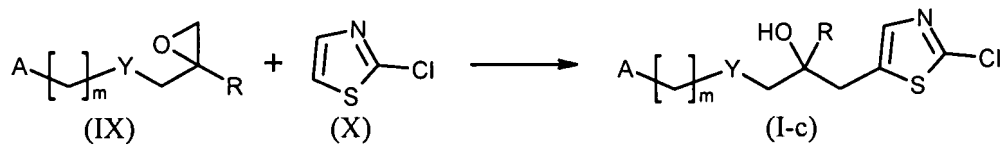
R^{1a} 為氯及 Si(烷基)₃。

R^{1b} 為氫、氯及 Si(烷基)₃。

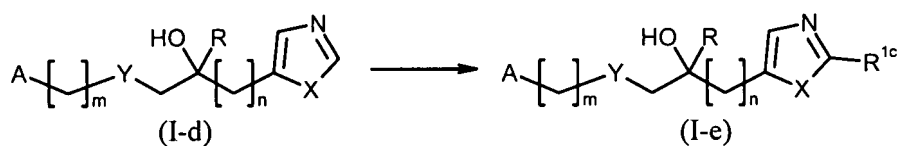
圖示 3：製法 C (n = 0, R¹ = H)

Y1 為 O。

圖示 4：製法 D (X = S, n = 1, R¹ = 氯)

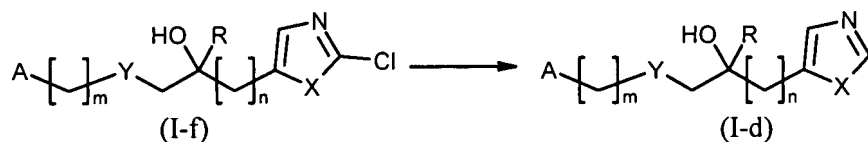


圖示 5：製法 E



R^{1c} 為 SH、烷基硫基、烷氧基、鹵素、鹵烷基、鹵烷基硫基、鹵烷氧基、氰基、硝基。

圖示 6：製法 F



於前文及下文之各式及圖示中之較佳的基團定義業已給定於前。此等定義不僅適用於式(I)之最終產物，而且同樣適用至所有的中間體。

製法 A

已知於進行根據本發明之製法 A 時需要用某些式(II)化合物作為啟始物質。其等可用已知方式製備(參閱 Z. Anorg. Allg. Chem. 2001, 627, 2408-2412)。

已知於根據本發明之製法 A 中亦需要用式(III)之酮作為啟始物質(參閱 EP-A 0 409 418)。

根據本發明之製法 A 典型地係於稀釋劑，例如二乙醚、四氫呋喃或二氯甲烷存在下，於 -80°C 至 $+80^{\circ}\text{C}$ 之溫度進行。該產生的產物係用質子提供者予以清除。

本發明之反應較佳於惰性氣體下進行，尤其例如氮或氬氣。

製法 B

已知於進行根據本發明之製法 B 時需要用某些式(IV)之酮作為啟始物質。其等可用已知方式製備(參閱 EP-A 0 409 418)。

已知於根據本發明之製法 B 中亦需要用式(V)之有機金屬雜環作為啟始物質(參閱 EP-A 0 409 418 及 EP-A 0 395 175)。

於製備式(V)有機金屬雜環之情況中，其可用適當的保護基，例如三甲基矽烷基有利地提供 2 位置，以便將 M^2 導入 5 位置。該保護基可於，但不需要，於與式(IV)酮進行反應之前予以移除。

根據本發明之製法 B 典型地係於稀釋劑，例如四氫呋喃或二乙醚存在下，於 -120°C 至 $+80^{\circ}\text{C}$ 之溫度進行。該產生的產物係用質子提供者予以清除。

本發明之反應較佳於惰性氣體如，尤其是氮或氬氣下進行。

製法 C

已知於進行根據本發明之製法 C 時需要用式(VII)化合物作為啟始物質。

已知於進行根據本發明之製法 C 時亦需要用某些式(VIII)環氧乙烷衍生物作為啟始物質。

新穎之環氧乙烷衍生物為那些式(VIII-a)



其中，

X 定義如前，

R^a 於各情況中為任意經取代之烷基(當 X 為 S 時，不包括第三丁基)、烯基、環烷基或芳基。

R^a 於各情況中較佳為任意分支的 C₃-C₇-烷基(當 X 為 S 時，不包括第三丁基)、C₁-C₈-鹵烷基、C₂-C₇-烯基、C₂-C₇-鹵烯基、任意經鹵素-、C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-鹵烷基-、C₁-C₄-烷氧基-、C₁-C₄-鹵烷氧基-、C₁-C₄-鹵烷基硫基-或 C₁-C₄-烷基硫基-取代之 C₃-C₇-環烷基，及任意經一-至三-鹵素-或 -C₁-C₄-烷基-取代之苯基。

R^a 於各情況中更佳為任意分支的 C₃-C₅-烷基(不包括第三丁基)、C₁-C₆-鹵烷基、C₃-C₅-烯基、C₃-C₅-鹵烯基、任意經鹵素-、C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-鹵烷基-、C₁-C₄-烷氧基-、C₁-C₄-鹵烷氧基-、C₁-C₄-鹵烷基硫基-或 C₁-C₄-烷基硫基-取代之 C₃-C₆-環

烷基。

Ra 最佳為異丙基、1-氯環丙基、1-氟環丙基、1-甲基環丙基、1-甲氧基環丙基、1-甲基硫基環丙基、(3E)-4-氯-2-甲基丁-3-烯-2-基、C₁-C₄-鹵烷基。

新穎之式(VIII-a)環氧乙烷衍生物同樣形成本發明主題之一部份。

根據本發明之製法 C 係在稀釋劑，例如 N,N-二甲基甲醯胺存在下，及任意於鹼，例如氫化鈉或碳酸鉀存在下進行。

製法 D

已知於進行根據本發明之製法 D 時需要用某些式(IX)環氧乙烷衍生物作為啟始物質(參閱 EP-A 0 121 171)。

2-氯-1,3-噻唑(X)係為已知。

於 IX 之轉化反應時，可使用有機金屬化合物，尤其是烷基鋰化合物(例如正丁基鋰)(參閱 EP-A 0 395 175)。

根據本發明之製法 D 典型地係於稀釋劑，例如四氫呋喃或二乙醚存在下，於-120°C 至+80°C 之溫度進行。該產生的產物係用質子提供者予以清除。

本發明之反應較佳於惰性氣體下進行，尤其例如氮或氬氣。

製法 E

於上述製法中製備之式(I-d)化合物可進一步轉化為一般結構之標的化合物(I-e)。

於式(I-d)化合物之轉化反應時，可使用有機金屬化合物，尤其是烷基鋰化合物(例如正丁基鋰)(參閱 EP-A 0 906 292)。

形成如中間體之有機金屬化合物典型地係與親電子劑(例如硫、烷基鹵化物、鹵間化合物)進行反應而得到標的化合物(I-e)。

根據本發明之製法 E 典型地係於稀釋劑，例如四氫呋喃或二乙醚存在下，於 -120°C 至 $+80^{\circ}\text{C}$ 之溫度進行。該產生的產物係用質子提供者予以清除。

本發明之反應較佳於惰性氣體如，尤其是氮或氬氣下進行。

製法 F

於上述製法中製備之式(I-f)化合物可進一步轉化為一般結構之標的化合物(I-d)。

於式(I-f)化合物之轉化反應時，可使用金屬，較佳為鋅(參閱 EP-A 0 395 175)。

根據本發明之製法 F 典型地係於稀釋劑，例如四氫呋喃或有機酸，例如醋酸存在下，於 -120°C 至 $+150^{\circ}\text{C}$ 之溫度進行。

本發明之通式(I)雜環烷醇衍生物可轉化為酸加成鹽或金屬鹽絡合物。

於製備通式(I)化合物之生理上可接受的酸加成鹽時，下列酸為較佳的選擇：氫鹵酸，例如氫氯酸及氫溴酸，尤其是氫氯酸，以及磷酸、硝酸、硫酸、單-及二官能羧酸及羥基羧酸，例如醋酸、順式丁烯二酸、琥珀酸、反式丁烯二酸、酒石酸、檸檬酸、水楊酸、山梨酸、乳酸、及磺酸，例如對甲苯磺酸及 1,5-萘二磺酸。

通式(I)化合物之酸加成鹽可用簡單的方式藉由形成鹽之習用方法，例如藉著將通式(I)化合物溶解於適當惰性溶劑中且添加酸，例如氫氯酸，且可用已知方式單離，例如藉著將其等過濾出來，且可任意藉著用惰性有機溶劑予以純化而獲得。

於製備通式(I)化合物之金屬鹽絡合物時，較佳之選擇為週期表之主族 II 至 IV 及過渡族 I 與 II 及 IV 至 VIII 之金屬鹽，其實例包括銅、鋅、錳、鎂、錫、鐵及鎳。

有用之鹽的陰離子包括那些較佳由下列酸所衍生者：氫鹵酸，例如氫氯酸及氫溴酸，以及磷酸、硝酸及硫酸。

該通式(I)化合物之金屬鹽絡合物可用簡單的方式藉習用製法，例如藉著將金屬鹽溶解於例如乙醇之醇中，且添加通式 I 化合物之溶液而獲得。金屬鹽絡合物可用已知方式單離，例如藉著將其等過濾出來，且可任意藉再結晶予以純化。

本發明又關於包含本發明活性組成份之作物保護組成物以用來控制不想要的微生物，尤其是不想要的真

菌。此等較佳為殺真菌組成物，其包含農業上適當之輔助劑、溶劑、載劑、表面活化劑或增量劑。

本發明亦關於控制不想要之微生物的方法，其特徵在於將本發明之活性組成份施用於植物致病性真菌及/或其等之棲息地。

根據本發明，載劑為天然或合成，有機或無機的物質，活性組成份係與其混合或合併而使施用性較佳，特別於施用至植物或植物部份或種子時。該載劑可為固態或液態，通常為惰性且應適用於農業上。

有用的固態或液態載劑包括：例如銨鹽及天然的岩石粉屑，如高嶺土、黏土、滑石、白堊、石英、活性白土、蒙脫土或矽藻土，及合成的岩石粉屑，如極度分散之矽石、氧化鋁及天然或合成的矽酸鹽，樹脂、油蠟、固態肥料、水、醇，尤其是丁醇、有機溶劑、礦物油及植物油，及其衍生物。可同樣使用此等載劑之混合物。用於顆粒之固態載劑包括：例如壓碎且分級之天然岩石如，方解石、大理石、浮石、海泡石、白雲石，及無機及有機粉類之合成顆粒，以及有機物質之顆粒如木屑、椰子殼、玉米穗軸及煙草稈。

有用之經液化的氣態增量劑或載劑為那些液體其於標準溫度及於標準壓力下為氣態者，例如氣溶膠推進劑如鹵化烴，以及丁烷，丙烷，氮及二氧化碳。

於調配物中，可使用膠黏劑如羧基甲基纖維素，及為粉末、顆粒及似格子之天然與合成的聚合物，如金合

歡膠、聚乙烯醇及聚乙烯基醋酸酯，或天然磷脂如腦磷脂及卵磷脂及合成磷脂。其他添加劑可為礦物油或植物油。

如果所使用的增量劑為水，其亦可使用例如，有機溶劑作為輔助溶劑。有用的液態溶劑實質上為：芳族類如二甲苯、甲苯或烷基萘，經氯化之芳族類及經氯化之脂族烴如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷，脂族烴如環己烷或石蠟，例如石油餾份、礦物油及植物油，醇如丁醇或乙二醇及其等之醚及酯，酮如丙酮、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，以及水。

本發明之組成物可另外包括其他組成份，例如表面活化劑。有用的表面活化劑為乳化劑及/或泡沫形成劑、分散劑或具有離子或非離子特性之潤濕劑，或此等表面活化劑之混合物。此等之實例為聚丙烯酸鹽類、木質素磺酸鹽類、苯酚磺酸或萘磺酸鹽類、氧化乙烯與脂族醇或與脂肪酸或與脂肪族胺之縮聚物、經取代之苯酚(較佳為烷基酚或芳基酚)、磺基琥珀酸酯的鹽、牛磺酸衍生物(較佳為烷基牛磺酸酯)、經聚乙氧基化之醇或苯酚的磷酸酯、多元醇之脂族酯，及含有硫酸鹽、磺酸鹽及磷酸鹽之化合物的衍生物，例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸鹽、烷基硫酸鹽、芳基磺酸鹽、蛋白質水解產物、木質素亞硫酸鹽廢液及甲基纖維素。若一種活性組成份及/或一種惰性載劑不溶於水且當施用於水中

時，必須存在有表面活化劑。表面活化劑之比例為本發明組成物之 5 及 40 重量%間。

可使用染料如無機顏料，例如氧化鐵，氧化鈦及普魯士藍，及有機染料如茜素染料、偶氮染料及金屬鈦花青染料，及微量元素如鐵、錳、硼、銅、鈷、鉬及鋅之鹽類。

如果適當，其亦可出現其他另外的組成份，例如保護性膠體、黏著劑、黏合劑、增稠劑、觸變性物質、滲透劑、穩定劑、多價螯合劑、絡合劑。通常，該活性組成份可與常用於調配目的之任何固態或液態添加物合併。

本發明之組成物及調配物通常含有 0.05 及 99 重量%，0.01 及 98 重量%間，較佳於 0.1 及 95 重量%間，更佳於 0.5 及 90%間，最佳於 10 及 70 重量%間之活性組成份。

本發明之活性組成份或組成物可如此地使用或，依其等之特別物理及/或化學性質而定，以其等之調配物型式或由其等所製備之使用型式，如氣溶膠、膠囊懸浮液、冷成霧濃縮物、熱成霧濃縮物、包膠顆粒、細顆粒、種子處理用流動性濃縮物、立即可用之溶液、散播用粉末、可乳化性濃縮物、水包油乳濁液、油包水乳濁液、大粒劑、微粒劑、油可分散之粉末、油可溶混之流動性濃縮物、油可溶混之液體、泡沫、糊劑、殺蟲劑包埋之種子、懸浮式濃縮物、懸浮式乳濁濃縮物、可溶性濃縮

物、懸浮液、可濕性粉劑、可溶性粉末、粉塵及顆粒、水溶性粒劑或錠劑、種子處理用水溶性粉末、可濕性粉末、用活性組成份浸透之天然產物及合成物質，以及於聚合物質中及於包埋物質中之種子用的微膠囊劑，以及 ULV 冷成霧及熱成霧調配物使用。

所提及之調配物可用本身已知的方式製備，例如，藉由將該活性組成份與至少一種習用增量劑、溶劑或稀釋劑、乳化劑、分散劑、及/或黏著劑或固定劑、潤濕劑、水份排除劑、如果適當、乾燥劑及 UV 穩定劑且，如果適當，染料及顏料、消泡劑、防腐劑、次級增稠劑、黏合劑、激勃素以及其他處理輔劑一起混合。

本發明之組成物不僅包括立即可用的調配物且可用適當設備施用至植物或種子，而且包括必須於使用前用水稀釋之市售濃縮物。

本發明之活性組成份可如此或於其等之(市售)調配物中及於由此等調配物所製備之使用型式中，以含有其他(已知的)活性組成份，如殺昆蟲劑、誘捕劑、殺菌劑、殺細菌劑、殺蟎蟲劑、殺線蟲劑、殺真菌劑、生長調節劑、除草劑、肥料、安全劑及/或化學傳訊素之混合物呈現。

用本發明之活性組成份或組成物處理植物及植物部分係直接進行或藉由習用處理方法，例如藉由浸泡、噴灑、噴霧、灌溉、蒸薰、撒粉、成霧、散播、成泡，塗抹、撒上、灑水(灌水)、滴灌作用於其等之環境、棲

息地或儲存空間上，且於繁殖物質之情況中，尤其於種子之情況中，亦藉由乾性種子處理、濕性種子處理、生料處理，形成痂殼，用單-或多層塗層包埋等。其亦可藉由超低容積法施展該活性組成份或注射該活性組成份製劑或該活性組成份本身至土壤中。

本發明進一步包括處理種子的方法。

本發明又關於藉由前段中所說明之一種方法處理的種子。本發明之種子係使用於保護種子免於不想要之微生物的方法中。於此等方法中，係使用經至少一種本發明之活性組成份處理過的種子。

本發明之活性組成份或組成物亦適於處理種子。大部份由有害生物所引起對於作用植物之損害係於貯存時或於播種後，以及於植物發芽之時及之後藉由種子感染而引發。此時期特別重要，因為成長中之植物的根及芽特別敏感，且即使輕微的損傷可導致植物死亡。因此，藉著使用適當的組成物來保護種子及發芽中之植物有很大的利益。

藉由處理植物的種子來控制植物致病性真菌業已知甚久且為持續改進的主題。然而，種子之處理仍有許多問題，其未必能以令人滿意的方式解決。例如，想要發展保護種子或發芽中之植物的方法，其於種植後或植物發芽後省掉，或至少明顯降低另外施展作物保護組成物。亦想要將所使用之活性組成份的數量最優化，以便種子及發芽中之植物得到最佳的保護以對抗植物致病

性真菌攻擊，而不會被所使用之活性組成份傷害植物本身。特別的，處理種子的方法亦應考慮基因轉殖植物本身之殺真菌性質，以使用最少量之作物保護組成物達到種子及發芽中之植物最佳的保護作用。

因此，本發明亦關於藉由用本發明之組成物來處理種子以保護種子及發芽中之植物免於被植物致病性真菌攻擊的方法。本發明同樣的係關於本發明之組成物處理種子以保護種子及發芽中之植物免於植物致病性真菌之用途。本發明進一步關於經本發明之組成物處理過以保護防止植物致病性真菌的種子。

植物致病性真菌損傷發芽後之植物的控制主要係藉著用作物保護組成物處理土壤及植物之地上部而進行。由於考慮到作物保護組成物可能影響環境及人類及動物的健康，仍需致力於降低活性組成份之施展數量。

本發明優點之一是，本發明之活性組成份及組成物特別的系統特性意指種子用此等活性組成份及組成物處理非僅保護種子本身，亦保護發芽後長成之植物免於植物致病性真菌。於此方式中，可免除於播種期或之後立即直接處理作物。

同樣認為有利的是本發明之活性組成份或組成物尤其亦可與基因轉殖種子使用，於此情況中，由此種子長成的植物能夠表現對抗害蟲作用之蛋白質。由於此等種子用本發明之活性組成份或組成物處理僅表現蛋白質，例如殺昆蟲性蛋白質，而可控制特定的害蟲。令人

驚奇的，其他協乘效應可於此情況中觀察到，其額外增加保護效應以對抗害蟲攻擊。

本發明之組成物適於保護農藝、溫室、森林或園藝及葡萄栽培上所使用之任何栽培品種植物的種子。特別的，此為穀類(如小麥、大麥、裸麥、小黑麥、高粱/粟及燕麥)、玉蜀黍、棉花、大豆、稻米、馬鈴薯、向日葵、豆類、咖啡、甜菜(例如甜菜及飼料甜菜)、花生、蕓苔、罌粟、橄欖、椰子、可可、甘蔗、煙草、蔬菜(如蕃茄、小黃瓜、洋蔥及萵苣)、草皮及觀賞植物(亦參見如下)的種子。穀類(如小麥、大麥、裸麥、小黑麥及燕麥)、玉蜀黍及稻米之種子的處理特別顯著。

如亦說明於下者，用本發明之活性組成份或組成物來處理基因轉殖種子特別顯著。此關係到含有至少一種能夠表現具有殺蟲特性之多胜肽或蛋白質之異種基因之植物的種子。基因轉殖種子中之異種基因可源自例如，桿菌、根菌瘤、假單胞菌屬、沙雷氏菌、木黴菌、環腐病菌、球囊黴菌或黏帚黴菌屬之微生物。此異種基因較佳源自芽孢桿菌，於此情況中，該基因產物可有效對抗歐洲玉米螟及/或西方玉米根蟲。該異種基因更佳源自蘇雲金芽孢桿菌。

於本發明之內文中，本發明之組成物係單獨或於適當調配物中施用於種子。較佳為，該種子係在足夠穩定之狀態下處理，使得處理過程中不會發生損傷。一般，種子可於收成與播種間之任何時間處理。習慣上，使用

業已從植物中分離出來之種子且不含硬軸，殼，柄，皮，茸毛或果實之果肉。例如，可使用業已收成，乾淨且乾燥至含量低於 15 重量%濕度之種子。或者，亦可使用乾燥後，例如，用水處理且然後再乾燥的種子。

當處理種子時，通常必須注意的是施用於種子之本發明組成物的數量及/或其他添加物的數量，係經選擇使得種子之發芽不會受損，或所生成之植物不會受到損傷。活性組成份於特定施用率具有植物毒性效應之情況時必須特別記住。

本發明之組成物可直接施用，亦即未含有任何其他組成份且無需予以稀釋。通常，較佳將組成物以適當調配物之型式施用至種子。用於種子處理之適當調配物及方法係已知於熟悉此項技藝之人士且說明於，例如，下列文獻中：US 4,272,417、US 4,245,432、US 4,808,430、US 5,876,739、US 2003/0176428 A1、WO 2002/080675、WO 2002/028186。

根據本發明可使用之活性組成份可轉化成習用之種子敷料調配物，如溶液、乳濁液、懸浮液、粉末、泡沫、生料或其他用於種子之包埋組成物，以及 ULV 調配物。

此等調配物係用已知方式，藉著將活性組成份與習用添加物，例如，習用增量劑以及溶劑或稀釋劑、染料、潤濕劑、分散劑、乳化劑、消泡劑、防腐劑、次級增稠劑、黏合劑、激勃素以及水混合而製備。

可存在於根據本發明可使用之種子敷料調配物中之有用的染料為習用於此等目的上之所有染料。可使用略溶於水之顏料，或可溶於水之染料。實例包括名為喏丹明 B(Rhodamine B)、C.I. 顏料紅色 112 及 C.I. 溶劑紅色 1 之已知染料。

可存在於根據本發明可使用之種子敷料調配物中之有用的潤濕劑為可促進潤濕且其為習用於活性農化組成份調配物上的所有物質。較佳使用烷基萘磺酸酯，如二異丙基或二異丁基萘磺酸酯。

可存在於根據本發明可使用之種子敷料調配物中之有用的分散劑及/或乳化劑為習用於活性農化組成份調配物上之所有非離子性、陰離子性及陽離子性分散劑。可使用之較佳者為非離子性或陰離子性分散劑或非離子性或陰離子性分散劑之混合物。適當之非離子性分散劑包括尤其是氧化乙烯/氧化丙烯嵌段聚合物，烷基酚聚乙二醇醚及三苯乙烯苯酚聚乙二醇醚，及其磷酸鹽或硫酸鹽衍生物。適當的陰離子性分散劑尤其是木質素磺酸鹽，聚丙烯酸鹽及芳基磺酸鹽/甲醛縮合物。

可存在於根據本發明可使用之種子敷料調配物中之消泡劑為習用於活性農化組成份調配物上之所有的泡沫抑制物質。較佳可使用矽酮消泡劑及硬脂酸鎂。

可存在於根據本發明可使用之種子敷料調配物中之防腐劑為可使用於農化組成物中此等目的上之所有的物質。實例包括二氯酚及苯醇半縮甲醛。

可存在於根據本發明可使用之種子敷料調配物中之次級增稠劑為可使用於農化組成物中此等目的上之所有的物質。較佳之實例包括纖維素衍生物、丙烯酸衍生物、黃原膠、經改質之黏土及極度分散之砂石。

可存在於根據本發明可使用之種子敷料調配物中之黏合劑為可使用於種子敷料產物中之所有習用黏著劑。較佳之實例包括聚乙烯基吡咯烷酮、聚乙烯基醋酸酯、聚乙烯醇及纖維基醋酸鈉。

可存在於根據本發明可使用之種子敷料調配物中之激勃素較佳為激勃素 A1, A3 (=赤黴酸), A4 及 A7; 特別佳係使用赤黴酸。激勃素係為已知(參看 R.威格勒“Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel” [作物保護組成物及農藥之化學], 第 2 卷, 史賓吉維拉克出版, 1970, 401-412 頁)。

根據本發明可使用之種子敷料調配物可直接或於先用水稀釋之後使用, 用來處理廣大範圍之不同種子, 包括基因轉殖植物的種子。於此情況中, 加成的協乘效應亦於與所形成之物質相互作用中藉由表現而發生。

用根據本發明可使用之種子敷料調配物, 或由其藉著添加水所製成之製劑來處理種子時, 可使用習用於種子敷料上之所有的混合裝置。於種子敷料之製法中, 特定將種子放進混合器中, 將以如此或先用水稀釋後之特別想要量之種子敷料調配物加入, 且將各物混合直到調

配物均勻地分佈於種子上。如果適當，接著進行乾燥操作。

本發明之活性組成份或組成物於作物保護上且於物質保護上具備有效的殺微生物活性且可用來控制不想要的微生物，如真菌及細菌。

殺真菌劑可使用於作物保護上用來控制根腫菌綱、卵菌綱、壺菌綱、接合菌綱、子囊菌綱、擔子菌綱及半知菌綱。

殺細菌劑可使用於作物保護上用來控制假單胞菌科、根瘤菌科、腸桿菌科、棒桿菌科及鏈黴菌科。

本發明之殺真菌組成物可用於治病性或保護性控制植物致病性真菌。因此，本發明亦關於控制植物致病性真菌之治病性及保護性的方法，其係藉著使用本發明之活性組成份或組成物，將其施用於種子、植物或植物部份、果實或植物生長的土壤。

於作物保護中用來控制植物致病性真菌之本發明的組成物包括有效但非植物毒性量之本發明的活性組成份。「有效，但非植物毒性量」意指足以令人滿意地控制植物之真菌性疾病或完全去除真菌性疾病，且其同時，不會導致任何顯著的植物毒性徵狀之本發明組成物的數量。此施用率通常可在相當大的範圍內變化。其係依許多因子，例如，依所要控制之真菌、植物、氣候條件及本發明組成物之組成份而定。

該活性組成份能充分使植物耐受於控制植物疾病

所需之濃度的事實，容許處理植物之地上部、繁殖莖及種子，及土壤。

根據本發明可處理所有的植物及植物部份。應瞭解本文中植物係指所有的植物及植物群，如想要的及不想要的野生植物或作物植物(包括自然成長的作物植物)。作物植物可為藉由習用培植及優選法或藉由生物技術及基因工程方法或此等方法之組合所獲得之植物，包括基因轉殖植物且包括栽培品種植物，其係被植物培育者權利所保護及未保護者。應瞭解植物部份係指植物地上及地下部分之所有的部份及器官，如芽、葉、花及根，其實例包括葉、針葉、柄、莖、花、果實體、果實、種子、根、球莖及塊根。植物之部份亦包括收穫之物質及營養性與生殖性繁殖的物質，例如，種苗、球莖、塊根、插枝及種子。

本發明之活性組成份，當其等被植物所充分耐受時，具備有利的溫血動物毒性且被環境所充分耐受時，係適用於保護植物及植物器官，以增進收成產量，改良收穫物質之品質。其等較佳被用作為作物保護組成物。其等於對抗一般敏感性及抗藥性種類且對抗所有或某些發展期具有活性。

可根據本發明處理之植物包括下列者：棉花、亞麻、葡萄、水果、蔬菜，如薔薇科(例如梨果果實如蘋果及洋梨，以及核果如杏桃、櫻桃、杏仁及桃子，及漿果如草莓)、醋栗、胡桃科、樺木科、漆樹科、殼斗科、

桑科，木犀科、獼猴桃科、樟科、芭蕉科(例如香蕉植物及香蕉栽種)、茜草科(例如咖啡)、茶科、梧桐科、芸香科(例如檸檬、柑橘及葡萄柚)；茄科(例如蕃茄)、百合科、菊科(例如萵苣)、繖形科、十字花科、藜科、葫蘆科(例如小黃瓜)、蔥科(例如韭菜、洋蔥)、蝶形花科(例如豌豆)；主要的作物植物如禾本科(例如玉蜀黍、草皮、穀類如小麥、裸麥、稻米、大麥、燕麥、粟及小黑麥)、禾本科(例如甘蔗)、菊科(例如向日葵)、十字花科(例如杏奶卷心菜、紅葉捲心菜、球花甘藍、花椰菜、球子甘藍、白菜、球莖甘藍、蘿蔔，以及蕓苔、芥菜、辣根及水芹)、豆科(例如豆、花生)、蝶形花科(例如大豆)、茄科(例如馬鈴薯)、藜科(例如甜菜、飼料甜菜、莖菜、甜菜根)；花園及森林中之有用植物及觀賞植物；及各個此等植物經基因改質之種類。

如業已提及於前者，根據本發明可處理所有的植物及其等之部份。於較佳之具體例中，可處理野生植物種及栽培植物，或那些藉由習用生物培植方法，如雜合或原質型融合，以及其部份所得到者。於其他較佳之具體例中，係處理基因轉殖植物及藉由基因工程方法，如果適當與習用方法(基因改質之有機體)合併所得到之栽培植物，及其部份。「部份」或「植物的部分」或「植物部份」一詞業已解釋於前。更佳者，根據本發明係處理各個市售可得或使用中之栽培品種的植物。應瞭解栽培植物係指具有新特性(「特點」)且業已藉由習用培植，

藉由誘變或藉由重組 DNA 技術而獲得之植物。其等可為栽培品種、變種、生物-或基因型。

本發明之處理方法可用來處理基因改質之有機體 (GMOs)，例如植物或種子。基因改質之植物(或基因轉殖植物)為其中異種基因業已穩定地整合至染色體組中之植物。「異種基因」表示法實質上係指基因其係於植物外提供或聚集，且當導入至核，葉綠粒或粒線體染色體組中時，藉由表現所介入之蛋白質或多胜肽或藉著向下調節或壓制存在於植物中之其他基因(使用例如反義技術、協乘抑制機制技術或 RNAi 技術[RNA 干擾])而得到轉化植物之新的或改良的農藝或其他特性。存在於染色體中之異種基因亦稱為轉殖基因。轉殖基因其係以其特定存在於植物染色體組中而定義者稱為轉換或基因轉殖事件。

依據植物種類或栽培品种植物，其等之位置及生長條件(土壤、氣候、生長期、養份攝取)，根據本發明之處理亦可產生超加成之(「協乘」)效應。例如，下列之效應：降低施用率及/或擴大活性範圍及/或提高可根據本發明使用之活性組成份及組成物的活性、植物生長較佳、提高對高溫或低溫之耐受性、提高對乾旱或對水分或土壤鹽分含量之耐受性、提高開花表現、較易收成、加速成熟、收成產量較高、果實較大、植株較高、葉色較綠、較早開花、收穫產物之品質較高及/或營養價值較高、果實中之糖濃度較高、收成產物之儲存安定性及

/或加工性較佳，可超過實際所預期的功效。

於特定施用率時，本發明之活性組成份於植物中亦可具有強固的效益。因此，其等亦適於穩定植物之防禦系統以對抗不想要的植物致病性真菌及/或微生物及/或病毒攻擊。此可為本發明組合之活性增強的理由之一，例如對抗真菌。於本文中應瞭解植物-強固的(抗性-誘發的)物質亦指那些能夠刺激植物防禦系統之物質或物質組合，用這樣的方式，當隨即接種不想要的植物致病性真菌時，所處理之植物對此等不想要的植物致病性真菌呈現實質的抗性程度。因此，本發明之物質可用來保護植物以於處理後一段特定期間內免於被所提之病原體攻擊。植物用該活性組成份處理後，其達到之保護期間延伸通常由 1 至 10 天，較佳由 1 至 7 天。

較佳根據本發明處理之植物及栽培品種植物包含具有授予至此等植物特別有利、有用特點之基因物質之所有的植物(不管是藉由培植及/或生物科技方式而獲得者)。

較佳亦根據本發明處理之植物及栽培品種植物為對於一種或多種生物壓力因子具抗性者，亦即該植物具有較佳的防禦以對抗動物及微生物害蟲，如對抗線蟲、昆蟲、蠕蟲、植物致病性真菌、細菌、病毒及/或類病毒。

亦可根據本發明處理之植物及栽培品種植物為那些對於一種或多種非生物壓力因子具抗性之植物。非生

物壓力條件可包括例如，乾旱、冷溫暴露、熱暴露、滲透壓力、浸水、土壤鹽度增加、對礦物暴露增加、對臭氧暴露、對強光暴露、有限的氮養分可利用性、有限的磷養分可利用性或缺乏遮蔽。

同樣可根據本發明處理之植物及栽培品種植物為那些其特徵在於提高產量特性之植物。於此等植物中提高產量可為，例如，改善植物生理、改良植物生長及發展的結果，如水份使用效率、水份停滯效益、改良氮使用、增加碳吸收、改進光合作用、提高發芽效率及加速成熟。產量亦可被改良之植物構造所影響(於壓力及非壓力條件下)，包括提早開花、於混種種子生產時之開花控制、種苗茁壯、植株大小、節間數及節間長度、根系生長、種子大小、果實大小、莢果大小、莢果數或穗數、每個莢果或每穗之種子數、種子粒重、增加種子飽實、降低種子分散、降低裂莢及抗倒伏。其他產量特點包含種子組成物，如碳水化合物含量、蛋白質含量、油含量及組成物、營養價值、降低抗-營養化合物、改善可加工性及較佳的儲存穩定性。

可根據本發明處理之植物為業已表現出混種優勢特性，或混種效應之混種植物，其通常導致較高的產量，茁壯，健康且對於生物及非生物壓力因子具抗性。此等植物典型地係藉由近親交配之雄性-不育的親系(雌性親系)與另一個近親交配之雄性-不育的親系(雄性親系)雜合而得。混種種子典型地係從雄性不育的植物中

收成且售予種植者。雄性不育植物有時(例如於玉蜀黍中)可藉著去除穗狀雄花(亦即機械式移除雄性生殖器官或雄花)而產生；然而，雄性不育較典型的係由植物染色體組中之基因決定因素所造成。於該情況中，且尤其當種子是從混種植物中收成之想要的產物時，其典型地有利於確信於含有對雄性不育負責之基因決定因素的混種植物中之雄性受精率係經完全修復的。此可藉由確信具有適當能夠修復混種植物中之雄性受精率之受精率修復基因的雄親，其能夠修復含有對雄性不育負責之基因決定因素之混種植物中的雄性受精率來完成。雄性不育之基因決定因素可位於細胞質中。細胞質雄性不育(CMS)之實例為例如說明於蕁苔屬中者。然而，雄性不育之基因決定因素亦可位於核染色體組中。雄性不育植物亦可藉由植物生物技術方法如基因工程而獲得。獲得雄性不育植物特別有用的方法係說明於 WO 89/10396 中，其中例如核糖核酸酶，如芽孢桿菌 RNA 酶(barnase)於雄蕊中係選擇性表現於脈絡膜細胞中。然後受精率可藉著於核糖核酸酶抑制劑，如芽孢桿菌 RNA 酶抑制劑(barstar)之脈絡膜細胞中表現而修復。

可根據本發明處理之植物或栽培品種植物(藉由植物生物技術方法如基因工程而獲得)為除草劑-耐受植物，亦即植物係對一種或多種給定之除草劑耐受。此等植物可藉著基因轉換，或藉著選擇含有授予此等除草劑耐受之突變的植物而獲得。

除草劑-耐受植物為，例如甘磷散(glyphosate)-耐受植物，亦即對除草劑甘磷散或其鹽耐受之植物。例如，甘磷散-耐受植物可藉著將具有基因編碼酵素 5-烯醇丙酮莽草酸-3-磷酸鹽合成酶(EPSPS)之植物轉化而獲得。此等 EPSPS 基因之實例為桿菌鼠傷寒沙門氏菌之 AroA 基因(突變種 CT7)、桿菌農桿菌之 CP4 基因、基因編碼之矮牽牛屬 EPSPS，蕃茄 EPSPS，或牛筋草 EPSPS。其亦可為突變的 EPSPS。甘磷散-耐受植物亦可藉著表現編碼甘磷散氧化還原酶酵素之基因而獲得。甘磷散-耐受植物亦可藉著表現編碼甘磷散乙醯轉化酶酵素之基因而獲得。甘磷散-耐受植物亦可藉著選擇含有上述基因之天然生成之突變的植物而獲得。

其他除草劑抗性植物為例如對抑制酵素谷醯胺合成酶，如雙丙胺磷、磷塞辛(phosphinothricin)或固殺草(glufosinate)之除草劑耐受的植物。此等植物可藉著表現將除草劑去毒化之酵素或表現對抑制作用具抗性之突變種谷醯胺合成酶酵素而獲得。一種此等有效去毒化之酵素為，例如，編碼磷塞辛乙醯轉化酶之酵素(如鏈黴菌屬之棒(bar)或塊(pat)蛋白質)。表現外因性磷塞辛乙醯轉化酶之植物業已說明。

其他除草劑-耐受植物亦為對抑制酵素羥基苯基丙酮酸鹽二氧酶(HPPD)之除草劑耐受的植物。羥基苯基丙酮酸鹽二氧酶為催化其中對-羥基苯基丙酮酸鹽(HPP)轉化成尿黑酸鹽之反應的酵素。對 HPPD 抑制劑耐受之

植物可用基因編碼天然生成之抗性 HPPD 酵素，或基因編碼突變之 HPPD 酵素轉化。對 HPPD 抑制劑耐受亦可藉著將具有基因編碼特定能夠形成高龍膽酸鹽之酵素的轉化植物而獲得，不管藉 HPPD 抑制劑來抑制天然的 HPPD 酵素。植物對 HPPD 抑制劑之耐受性亦可藉著將具有基因編碼酵素預苯酸鹽脫氫酶以及基因編碼 HPPD 耐受性酵素之轉化植物而改善。

其他除草劑-抗性植物為對乙醯醋酸酯合成酶(ALS)抑制劑耐受之植物。已知的 ALS 抑制劑包含，例如，磺醯脲、咪唑啉酮、三唑并嘧啶，嘧啶基氧基(硫基)苯甲酸酯及/或磺醯胺基羰基三唑啉酮除草劑。於 ALS 酵素(亦已知為乙醯羧基酸合成酶，AHAS)中之不同的突變作用係已知授予耐受性至不同的除草劑及除草劑群組上。磺醯脲-耐受植物及咪唑啉酮-耐受植物之生產業已說明於國際公開案 WO 1996/033270 中。其他磺醯脲-及咪唑啉酮-耐受植物亦已說明於例如 WO 2007/024782 中。

對咪唑啉酮及/或磺醯脲耐受之其他植物可藉著經誘發之誘變，藉著於除草劑存在下之細胞培養中選擇或藉著突變培植而獲得。

亦可根據本發明處理之植物或栽培植物(藉由植物生物技術法如基因工程而獲得)為昆蟲-抗性基因轉殖植物，亦即藉由特定標的昆蟲攻擊使植物具抗性。此等

植物可藉由基因轉換，或藉由選擇含有突變授予此等昆蟲抗性之植物而獲得。

於本文中，「昆蟲-抗性基因轉殖植物」包括含有至少一種包含編碼順序碼之轉殖基因的任何植物：

- 1) 來自蘇雲金芽孢桿菌或其殺昆蟲部份之殺昆蟲結晶性蛋白質，如編列於：
[http://www.lifesci.sussex.ac.uk/](http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/)
Home/Neil_Crickmore/Bt/線上之殺昆蟲結晶性蛋白質，或其殺昆蟲部份，例如，Cry 蛋白質等級 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry2Ab、Cry3Aa、或 Cry3Bb 之蛋白質或其殺昆蟲部份；或
- 2) 來自蘇雲金芽孢桿菌或其部份之結晶性蛋白質，其係於蘇雲金芽孢桿菌或其部份之第二種其他結晶性蛋白質，如由 Cry34 及 Cry35 結晶性蛋白質所構成之二元毒素存在之下具殺昆蟲性；或
- 3) 混種殺昆蟲性蛋白質，其包含蘇雲金芽孢桿菌之二種不同殺昆蟲結晶性蛋白質的部份，如前文 1) 之蛋白質混種或前文 2) 之蛋白質混種，例如由玉米事件 MON98034 (WO 2007/027777) 所產生之 Cry1A.105 蛋白質；或
- 4) 前文 1) 至 3) 之任一種蛋白質，其中某些，特別是 1 至 10，胺基酸被另一種胺基酸所替代而得到對標的昆蟲種較高之殺昆蟲活性，及/或擴大受影響之標的昆蟲種的範圍，及/或因為於選殖或轉換時編碼

- DNA 中所誘發之改變，如於玉蜀黍事件 MON863 或 MON88017 中之 Cry3Bb1 蛋白質，或於玉蜀黍事件 MIR604 中之 Cry3A 蛋白質；或
- 5) 來自蘇雲金芽孢桿菌或蠟狀芽孢桿菌之殺昆蟲隱藏性蛋白質，或其殺昆蟲部份，如列舉於：http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html 中之植物性殺昆蟲蛋白質(VIP)，例如來自 VIP3Aa 蛋白質等級之蛋白質；或
 - 6) 來自蘇雲金芽孢桿菌或蠟狀芽孢桿菌之隱藏性蛋白質，其於蘇雲金芽孢桿菌或蠟狀芽孢桿菌之第二種隱藏性蛋白質，如由 VIP1A 及 VIP2A 蛋白質所構成之二元毒素，存在之下具殺昆蟲性；
 - 7) 混種殺昆蟲蛋白質，其包含來自蘇雲金芽孢桿菌或蠟狀芽孢桿菌之不同隱藏性蛋白質的一部份，如前文 1)中之蛋白質的混種或前文 2)中之蛋白質的混種；或
 - 8) 前文 1)至 3)點中之任一種蛋白質，其中某些，特別是 1 至 10，胺基酸業已被另一種胺基酸所替代而得到對標的昆蟲種具有較高之殺昆蟲活性，及/或擴大受影響之標的昆蟲種的範圍，及/或因為於選殖或轉換時編碼 DNA 中所誘發之改變(雖然仍編碼殺昆蟲蛋白質)，如棉花事件 COT102 中之 VIP3Aa 蛋白質。

當然，昆蟲-抗性基因轉殖植物，如本文中所用者，亦包含任何植物，其包括基因編碼上述 1 至 8 種中任一

種蛋白質之組合者。於一個具體例中，昆蟲-抗性植物含有超過一種轉殖基因編碼上述 1 至 8 種中任一種之蛋白質，藉著使用不同的蛋白質對相同但具有不同作用模式之標的昆蟲種別，如於昆蟲中不同受體之結合位置結合以擴大受影響標的昆蟲種別之範圍，或延遲昆蟲對植物抗性之發展而殺昆蟲。

亦可根據本發明處理之植物或栽培植物(藉由植物生物技術方法如基因工程而獲得)係對非生物壓力因子具耐受者。此等植物可藉基因轉換，或藉選擇含有突變授予此等壓力抗性之植物而獲得。特別有用之壓力-耐受性植物包括下列者：

- a. 於植物細胞或植物中含有轉殖基因能夠降低多(ADP-核糖)聚合酶(PARP)基因表現及/或活性之植物；
- b. 能夠降低植物或植物細胞之 PARP-編碼基因表現及/或活性之含有壓力耐受-增強轉殖基因的植物；
- c. 含有壓力耐受-增強轉殖基因編碼於菸草醯胺腺嘌呤二核苷酸挽救生物合成途徑之植物-官能酵素，包括菸草醯胺酶、菸草醯胺化物磷核糖基轉化酶、菸酸一核苷酸腺苷基轉化酶、菸草醯胺腺嘌呤二核苷酸合成酶或菸草醯胺磷核糖基轉化酶之植物。

亦可根據本發明處理之植物或栽培植物(藉由植物生物技術方法如基因工程而獲得)顯示收成產物之數

量、品質及/或貯存穩定性改變及/或收成產物之特定組成份的性質改變，如：

- 1) 基因轉殖植物其合成改質之澱粉，相較於野生型植物細胞或植物中所合成之澱粉，其於化學物理特點，特別是澱粉醣含量或澱粉醣/澱粉果膠比例，分支程度，平均鏈長，側鏈分佈，黏性性質，凝膠抗性，澱粉之顆粒大小及/或顆粒形體上係經改變，使得此種改質的澱粉較適合特定施用。
- 2) 基因轉殖植物其合成非澱粉碳水化合物聚合物或其合成具有改變性質之非澱粉碳水化合物聚合物者，與野生型植物相較時，無需改變基因。實例為產生多果糖，尤其菊糖及左聚糖-型式之植物、產生 α -1,4-聚葡萄糖之植物、產生 α -1,6分支 α -1,4-聚葡萄糖之植物，及產生交替之植物。
- 3) 產生乙醯透明質酸之基因轉殖植物。

亦可用根據本發明處理之植物或栽培植物(藉由植物生物技術方法如基因工程而獲得)為具有改變纖維特性之植物，如棉花植物。此等植物可藉由基因轉換，或藉由選擇含有突變授予此等改變纖維特性之植物而獲得且包括：

- a) 含有改變型式之纖維素合成酶基因的植物，如棉花植物；
- b) 含有改變型式之 rsw2 或 rsw3 同系核酸的植物，如棉花植物；

- c) 具有提升蔗糖磷酸酯合成酶表現之植物，如棉花植物；
- d) 具有提升蔗糖合成酶表現之植物，如棉花植物；
- e) 植物，如棉花植物，其中於纖維細胞基質之胞間連絲選通的時機改變，例如經由向下調節纖維-選擇性 β 1,3-聚葡萄糖酶者；
- f) 具有改變反應性纖維之植物，如棉花植物，例如經由包含 nodC 及甲殼素合成酶基因之 N-乙酰葡萄糖胺轉化酶基因表現者。

亦可根據本發明處理之植物或栽培植物(藉由植物生物技術方法如基因工程而獲得)為具有改變之油態樣特性的植物，如蕓苔或相關之蕓苔植物。此等植物可藉由基因轉換，或藉由選擇含有授予此等改變油特性之突變的植物而獲得且包括：

- a) 產生具有高油酸含量之油的植物，如蕓苔植物；
- b) 產生具有低次亞麻油酸含量之油的植物，如蕓苔植物；
- c) 產生具有低含量飽和脂肪酸之油的植物，如蕓苔植物。

可根據本發明處理之特別有用的基因轉殖植物為包含一種或多種基因之植物，其編碼一種或多種毒素者為基因轉殖植物，其係以下列商標名稱販售：YIELD GARD® (例如玉蜀黍、棉花、大豆)、KnockOut® (例如玉蜀黍)、BiteGard® (例如玉蜀黍)、BT-Xtra® (例如玉

蜀黍)、StarLink® (例如玉蜀黍)、Bollgard® (棉花)、Nucotn® (棉花)、Nucotn 33B® (棉花)、NatureGard® (例如玉蜀黍)、Protecta®及 NewLeaf® (馬鈴薯)。可提及之除草劑-耐受植物的實例為玉蜀黍栽培品種、棉花栽培品種及大豆栽培品種，其可得自於商標名稱：Roundup Ready®(對甘磷散耐受，例如玉蜀黍、棉花、大豆)，Liberty Link®(對膦塞辛耐受，例如莖苔)，IMI®(對咪唑啉酮耐受)及 SCS®(對磺醯脲耐受，例如玉蜀黍)。可提及之除草劑-抗性植物(以習用方式培育對除草劑耐受之植物)包括以 Clearfield®(例如玉蜀黍)名稱販售之栽培品種。

可根據本發明處理之特別有用的基因轉殖植物為含有轉換事件，或轉換事件組合之植物，且其列舉於例如各國或區域法規機構之資料庫中(參見例如 http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx 及 <http://www.agbios.com/dbase.php>)。

本發明之活性組成份或組成物亦可用於保護物質，用來保護工業物質對抗被不想要的微生物，例如真菌及昆蟲之攻擊及破壞。

此外，本發明化合物可用作為抗附著組成物，單獨或與其他活性組成份合併使用。

應瞭解於本文中工業物質係指業已製備用於工業上之無生命物質。例如，藉由本發明之活性組成份保護而免於微生物改變或破壞之工業物質，其可為黏合劑、

膠水、紙張、壁紙及木板、織物、地毯、皮革、木頭、塗料及塑膠品、冷卻潤滑劑及可被微生物感染或破壞之其他物質。可被微生物之增殖而損傷的植物及建築物生產的部分，例如冷卻水回路、冷卻及加熱系統及通風與空調裝置亦於所要保護物質之範圍中提及。本發明範圍內之工業物質較佳包括黏合劑、膠水、紙張及硬紙板、皮革、木頭、塗料、冷卻潤滑劑及熱交換流體，以木頭較佳。本發明之活性組成份或組成物可避免不利的影響，如腐爛、蛀蝕、褪色、脫色或發霉。此外，本發明化合物可用於保護與海水或鹼水接觸之物體，特別為船體、篩子、網、建築物，停泊及信號系統免於腐爛。

用來控制不想要之真菌的本發明方法亦可用來保護儲存物品。應瞭解儲存物品係指蔬菜或動物來源之天然物質及其加工產物，其係天然來源者，且係想要長期保護者。蔬菜來源，如植物或植物部分，如莖、葉、球莖、種子、果實、穀粒之儲存物品可以新鮮收成或藉由(預先)乾燥、變濕、研成粉末、磨碎、壓碎或烘烤加工後保護。儲存物品亦包括木材，未加工者(如建築木材、電桿及柵欄)或為完成品之型式(如傢俱)二者。動物來源之儲存物品為，例如，獸皮、皮革、毛皮及獸毛。本發明之活性組成份可避免不利的效應如腐爛、蛀蝕、褪色、脫色或發霉。

可根據本發明處理之真菌性疾病之病原體的非限制性實例包括：

由白粉病病原體所引起之疾病，例如禾白粉菌屬，例如小麥白粉菌；叉絲單囊殼屬，例如白叉絲單囊殼菌；單絲殼屬，例如菌蒼耳單絲殼菌；鈎絲殼屬，例如葡萄鈎絲殼菌；

由銹病病原體所引起的疾病，例如膠銹菌屬，例如檜膠銹菌(*Gymnosporangium sabinae*)；駝孢銹菌屬，例如咖啡駝孢銹菌；層銹菌屬，例如豆薯層銹菌及山馬蝗層銹菌；柄銹菌屬，例如隱匿柄銹菌或小麥柄銹菌(*Puccinia triticina*)；單胞銹菌屬，例如疣頂單胞銹菌；

由卵菌綱類之病原體所引起的疾病，例如盤梗黴屬，例如萵苣盤梗黴；霜黴屬，例如碗豆霜黴或莖苔霜黴；疫黴屬，例如致病疫黴；單軸黴屬，例如葡萄生單軸黴；假霜黴屬，例如葎草假霜黴或古巴假霜黴；腐黴屬，例如終極腐黴；

葉斑病及葉凋病，其係由例如，鏈格孢屬，例如馬鈴薯鏈格孢；尾孢屬，例如蒸菜生尾孢；枝孢屬，例如甜瓜枝孢(*Cladosporium cucumerinum*)；旋胞腔菌屬，例如禾旋胞腔菌(分生孢生型式：德克塞氏菌，共：長蠕孢屬)；刺盤孢屬，例如豆刺盤孢；環錐病菌屬(*Cycloconium*)，例如油橄欖環錐病菌(*Cycloconium oleaginum*)；間座殼屬，例如柑橘間座殼菌；痂囊腔菌屬，例如柑橘痂囊腔菌；盤長孢屬，例如悅色盤長孢；小叢殼屬，例如圍小叢殼；球座菌屬，例如葡萄球座菌；小球腔菌屬，例如斑點小球腔菌(*Leptosphaeria*

maculans); 小粒菌核病菌屬 (*Magnaporthe*), 例如稻小粒菌核病菌; 雪腐病菌屬 (*Microdochium*), 例如紅色雪腐病菌 (*Microdochium nivale*); 球腔菌屬, 例如禾生球腔菌及香蕉球腔菌 (*M. fijiensis*); 小暗球殼屬, 例如穎枯小暗球殼菌; 核腔菌屬, 例如圓核腔菌; 柱隔孢屬, 例如可洛塞尼柱隔孢菌 (*Ramularia collo-cygni*); 喙孢屬, 例如黑麥喙孢; 殼針孢屬, 例如芥菜葉小殼針孢; 核瑚菌屬, 例如內孢核瑚菌; 黑星菌屬, 例如蘋果黑星菌所引起;

根及莖幹疾病, 其係由, 例如伏革菌屬, 例如禾伏革菌; 鏈孢黴屬, 例如尖鏈孢黴; 頂囊殼菌屬, 例如禾頂囊殼菌; 絲核菌屬, 例如立枯絲核菌; 泰比菌屬 (*Tapesia*), 例如泰比菌 (*Tapesia acuformis*); 根串珠黴屬, 例如根串球黴所引起;

穗及圓錐花序疾病(包括玉蜀黍穗軸), 其係由, 例如, 鏈格孢屬, 例如鏈格孢菌; 曲菌屬, 例如柄曲黴; 枝孢屬, 例如芽枝狀枝孢菌; 麥角菌屬, 例如麥角菌; 鏈孢黴屬, 例如大刀鏈孢黴; 赤黴屬, 例如玉蜀黍赤黴; 雪黴葉枯菌屬 (*Monographella*), 例如小麥雪黴葉枯菌 (*Monographella nivalis*); 殼針孢屬, 例如穎枯殼針孢所引起;

由黑穗病真菌, 例如軸黑粉菌屬, 例如絲軸黑粉菌; 腥黑粉菌屬, 例如小麥網腥黑粉菌、小麥矮腥黑粉菌; 條黑粉菌屬, 例如隱條黑粉菌; 黑粉菌屬, 例如裸

黑粉菌、小麥裸黑粉菌所引起的疾病；

果實腐病係由，例如曲菌屬，例如，柄曲黴；葡萄孢屬，例如，灰葡萄孢；青黴屬，例如擴展青黴菌及產紫青黴菌；小核菌屬，例如核盤菌；輪枝孢屬，例如黃萎輪枝孢菌所引起；

種子-及土壤-媒介之腐爛及凋萎疾病，以及種苗之疾病係由，例如，鏈孢黴屬，例如大刀鏈孢黴；疫黴屬，例如惡疫黴；腐黴屬，例如終極腐黴；絲核菌屬，例如立枯絲核菌；小核菌屬，例如小核菌所引起；

癌症、癭及叢枝病係由，例如，叢赤殼屬，例如，癭叢赤殼所引起；

凋萎疾病係由，例如，鏈核盤菌屬，例如，核果鏈核盤菌所引起；

葉、花及果實之畸形係由，例如，外囊菌屬，例如，畸型外囊菌所引起；

木本植物之退化性疾病係由，例如，艾斯卡菌屬 (*Esca species*)，例如，褐念珠串菌 (*Phaeoconiella chlamydospora*)及 *Phaeoacremonium aleophilum* 及地中海層臥孔菌 (*Fomitiporia mediterranea*)所引起；

花及種子之疾病係由，例如，葡萄孢屬，例如，灰葡萄孢所引起；

植物球莖之疾病係由，例如，絲核菌屬，例如，立枯絲核菌；長蠕孢屬，例如，腐衣長蠕孢菌所引起；

由細菌病原菌，例如，黃單孢菌屬，例如野油菜黃

單胞菌變種；假單胞菌屬，例如丁香假單胞菌甜瓜致病變種；歐文氏菌屬，例如解澱粉歐文氏菌所引起之疾病。

控制下列之大豆疾病較佳者為：

於葉、莖、莢及種子上之真菌性疾病，其係由，例如，鏈格孢屬黑斑病(鏈格孢菌(*Alternaria spec. atrans tenuissima*))、炭疽病(大豆孢狀刺盤孢變種(*Colletotrichum gloeosporoides dematium var. truncatum*)、褐斑(大豆殼針孢)、尾孢屬褐斑病及疫病(菊池尾孢)、笄黴屬葉疫病(漏斗笄黴菌三孢(*Syn.*)、疏毛核菌黴屬葉斑(大豆疏毛核菌霉屬)、露菌病(東北霜黴)、長蠕孢枯病(大豆長蠕孢菌)、大豆尾孢、小光殼菌屬葉斑(三葉草小光殼菌)、葉點黴屬葉斑(大豆生葉點黴)、莢及莖疫病(大豆擬莖點黴)、白粉病(大豆白粉病菌)、棘殼孢屬葉斑(大豆棘殼孢菌)、絲核菌屬氣生、葉及網狀疫病(立枯絲核菌)、銹病(豆薯層銹菌、山馬蝗層銹菌)、痂(大豆痂圓孢)、輪紋病菌屬葉疫病(匍柄黴)、小圓盾斑(山扁豆生棒孢)所引起。

在根及莖基上之真菌疾病係由，例如，黑根腐病(麗赤刺殼菌(*Calonectria crotalariae*))，菜豆殼球孢，鏈孢黴疫病或凋萎，根腐，及莢與軸環腐病(枯萎病菌、豌豆直喙鏟孢、半裸鏟孢、木賊鏟孢)，大豆褐紅壞死病菌，新赤殼屬(侵管新赤殼)，莢及莖疫病(菜豆間座殼菌)，莖潰瘍(變種菜豆間座殼菌(*Diaporthe phaseolorum var. caulivora*))，疫黴屬腐病(大雄疫黴)，褐莖腐病(大

豆莖褐腐病菌)，腐黴屬腐病(瓜果腐黴)、畸雌腐黴、德巴利腐黴、群結腐黴，終極腐黴，絲核菌屬根腐病，莖腐爛，及猝倒病(立枯絲核菌)，核盤黴屬莖腐爛(核盤菌)，小核菌白絹病(齊整小核菌)，根串珠黴屬根腐(根串珠黴菌)所引起。

能夠分解或改變工業物質之微生物包括，例如，細菌、真菌、酵母菌、藻類及黏質有機體。本發明之活性組成份較佳作用來對抗真菌，尤其是黴菌(moulds)，木頭褪色及破壞木頭之擔子菌綱，及對抗黏質有機體及藻類。實例包括下列屬之微生物：鏈格孢屬如細鏈格子孢；曲菌屬，如黑曲菌；毛殼菌屬，如球毛殼黴菌；粉孢革菌屬，如粉孢革菌；香菇屬，如虎皮香菇；青黴屬，如灰綠青黴；多孔屬，如變色多孔菌；短梗黴屬，如出芽短梗黴；指疫黴屬如比提指疫黴菌(*Sclerophoma pityophila*)；木黴菌屬，如綠木黴；埃希氏菌屬，如大腸桿菌；假單胞菌屬，如綠膿桿菌；葡萄球菌屬，如金黃色葡萄球菌。

此外，本發明之活性組成份亦具有極佳的抗黴菌活性。其等具有非常寬的抗黴菌活性範圍，尤其對抗皮黴菌及酵母菌、黴菌及二相真菌(例如對抗念珠球菌屬，如白色念珠球菌、光滑念珠球菌)，及捲毛表皮癬菌，曲菌屬如黑曲菌及烟曲黴，毛癬菌屬如鬚髮癬菌，小孢子菌屬如犬小孢子菌及奧杜安氏小孢子菌(*audouinii*)。此等真菌之清單絕不會限制其所涵蓋之抗黴菌範圍，且

僅用來闡明特性。

因此，本發明之活性組成份可用於醫學及於非醫學應用二者中。

當使用本發明之活性組成份作為殺真菌劑時，依施用之種類而定，施用率可在相當廣大範圍內變化。本發明活性組成份之施用率為

- 於處理植物部份，例如葉片之情況中：由 0.1 至 10,000 克/公頃，較佳由 10 至 1,000 克/公頃，更佳由 50 至 300 克/公頃(於灌水或滴灌施用之情況中，甚至可降低施用率，尤其當使用惰性物質如石棉或珍珠岩時)；
- 於種子處理之情況中：每 100 公斤種子係由 2 至 200 克，每 100 公斤種子較佳由 3 至 150 克，每 100 公斤種子較佳係由 2.5 至 25 克，每 100 公斤種子更佳係由 2.5 至 12.5 克；
- 於土壤處理之情況中：由 0.1 至 10,000 克/公頃，較佳由 1 至 5,000 克/公頃。

此等施用率僅係藉實例說明且並非用來限制本發明之目的。

因此，本發明之活性組成份或組成物可於處理後之特定期間保護植物免於被所提之病原體攻擊。用活性組成份處理植物後，所提供之保護期通常延長達 1 至 28 天，較佳達 1 至 14 天，較佳達 1 至 10 天，最佳達 1 至 7 天，或於種子處理後達至多 200 天。

此外，本發明之處理可降低所收穫的物質及食物及

由其所製成之食物中之黴菌毒素(mycotoxins)含量。黴菌毒素特別包括，但非侷限於下列者：去氧雪腐鐮刀菌烯醇(DON)、雪腐鐮刀菌烯醇、15-Ac-DON、3-Ac-DON、T2-及 HT2-毒素、伏馬蘭素、玉米烯酮、串珠鐮刀菌素、鐮菌素、二醋酸蔗草鐮刀菌烯醇(DAS)、白僵菌素、恩鐮孢菌素、層出鐮孢菌素、弗沙諾(fusarenol)、赭曲黴毒素、棒曲霉毒素、麥角生物鹼及黃曲霉毒素且其可，例如藉由下列真菌：鐮孢黴屬，如銳頂鐮孢、燕麥鐮孢、克地鐮孢、大刀鐮孢、禾本科鐮孢(玉蜀黍赤黴)、木賊鐮孢、斐濟鐮孢(*F. fujikoro*)、香蕉鐮孢(*F. musarum*)、尖鐮孢、再育鐮孢、早熟禾鐮孢、假禾鐮孢(*F. pseudograminearum*)、接骨木鐮孢、蔗草鐮孢、半裸鐮孢、腐皮鐮孢、擬分枝孢鐮孢、朗塞鐮孢(*F. langsethiae*)、亞粘團鐮孢(*F. subglutinans*)、三隔鐮孢、輪枝樣鐮孢(*F. verticillioides*)尤其，以及由曲菌屬、青黴屬、麥角菌、葡萄穗黴屬而產生。

於某些情形中，本發明化合物於特別之濃度或施用率時，亦可用作為除草劑、安全劑、生長調節劑或改善植物性質之試劑，或作為殺菌劑，例如作為殺真菌劑、抗黴菌物、殺細菌劑、殺類病毒劑(包括組成物對抗類病毒)或作為組成物對抗 MLO (黴漿菌屬-類生物)及 RLO (立克次體屬-類生物)。如果適當，其等亦可於其他活性組成份之合成中用作為中間體或先質。

本發明之活性組成份介入植物之代謝中且因此可

用作為生長調節劑。

植物生長調節劑可於植物上發揮各種效果。該物質之效力實質上係依與植物生長期相關之施用時間而定，且亦依活性組成份施用至植物或其等之環境上的數量而定，且依施用之類型而定。於各情況中，生長調節劑應具有於作物植物上特別想要的效果。

植物之生長調節化合物可用來，例如，抑制植物之營養性生長。此等之生長抑制係具經濟利益，例如，於草類之情況中，因為其可如此而於觀賞花園、公園或運動場所中，於路邊，於機場或於果實作物中降低割草的頻率。於路邊上且於管道或高架纜繩附近，或於一般不想要植物生長茂盛的地方抑制草本及木本植物的生長亦具重大的意義。

亦重要的是使用生長調節劑來抑制穀類之縱向生長。此降低或完全排除於收穫前植物倒伏的風險。此外，於穀類之情況中，生長調節劑可強化空心莖，其亦可對抗倒伏。生長調節劑使用於矮化及強化空心莖上可容許施展較高的肥料容量以增加產量，而穀類作物不會有任何倒伏的風險。

於許多作物植物中，抑制營養性生長可容許密集種植，且因此可依據土壤表面而達到較高的產量。以此方式獲得較小植株之另一個優點是容易耕種及採收該作物。

抑制營養性植物生長亦可導致產量增加，因為養分

及養分吸收比起植物之營養性部份，其較有利於開花及果實形成。

生長調節劑亦可頻繁地用於促進營養性生長。當採收營養性之植物部份時，此極為有利。然而，促進營養性生長亦可促進吸收養份較多之生殖性生長形成，而導致較多或較大的果實。

於某些情形中，產量增加可藉著操作植物之代謝來達成，而於營養性生長中沒有任何可偵測到的改變。此外，生長調節劑可用於改變植物之組成物，其同樣可導致收穫產物之品質改善。例如，可增加甜菜、甘蔗、鳳梨及柑橘果實中之糖份含量，或可增加大豆或穀類中之蛋白質含量。亦可，例如，使用生長調節劑來抑制想要的組成份，例如甜菜或甘蔗中之糖份，於收穫前或後降解。其亦可正性影響次要植物組成份之生產或消除。一個實例為於橡膠樹中刺激乳膠流動。

於生長調節劑影響之下，可形成無籽果實。此外，可影響花的性別。亦可產生不育的花粉，其於混種種子之培植及生產中非常重要。

使用生長調節劑可控制植物之分枝。一方面，藉由破壞頂端優勢而促進側芽發展係高度想要的，特別於觀賞植物之栽培中，亦合併抑制生長。然而，另一方面，其亦可抑制側芽生長。此效果特別有利，例如，於菸草栽培中或於蕃茄栽培中。

於生長調節劑影響之下，可控制植物上的葉數，使

得植物於想要的時間落葉。此等落葉於機械採收棉花時扮演重要的角色，而且有利於使其他作物，例如於葡萄栽培中採收容易。植物之落葉亦可於其等移植之前進行，以降低植物的蒸發作用。

生長調節劑可同樣用於調節裂果。一方面，可避免不成熟的果實裂開。另一方面，亦可促進裂果或甚至疏花以達到想要的質量(「疏理」)，以便消除交替。應瞭解交替係指某些果實類的特性，由於內因性理由，每年提供非常不同的生產量。最後，可於收穫期使用生長調節劑以降低分果所需之力，以便容許機械式採收或利於手工採收。

亦可於收穫之前或後使用生長調節劑，使所收穫之物質加快或延遲成熟。特別有利的是其容許最優化調節至市場需求。再者，於某些情形中生長調節劑可改善果實的顏色。此外，生長調節劑亦可於特定時期內使用以集中成熟。此係建立於完全機械式或手工採收之單一作業上事先所必須的，例如，於菸草、蕃茄或咖啡之情況中。

藉著使用生長調節劑，其另外可影響植物之種子或芽苞的休眠，使得於苗圃中在正常下其等於此時期不傾向如此做之植物如鳳梨或觀賞植物進行，例如，發芽、抽條或開花。於具有霜降風險之地區中，想要借助於生長調節劑來延遲芽苞生成或發芽，以避免晚霜所造成之損傷。

最後，生長調節劑可誘發植物對霜降、乾旱或高鹽分土壤之抗性。此容許植物可於正常下不適於此目的之區域中進行栽培。

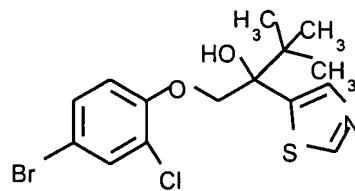
所列舉之植物以根據本發明之通式(I)化合物及本發明之組成物處理時特別有利。上述該活性組成份或組成物時之較佳範圍亦適用於此等植物之處理。特別強調的是用本文中特別提及之化合物或組成物來處理植物。

本發明係藉實例闡明如下。然而，本發明並非侷限於該實例。

【實施方式】

製備實例

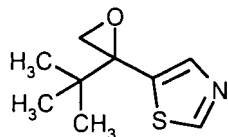
2 號化合物之製備(製法 C)



於溶解於 10 毫升 N,N-二甲基甲醯胺之 0.62 克(3.0 毫莫耳) 4-溴-2-氯苯酚中，於室溫氫氣壓下添加 0.12 克(60%，3.0 毫莫耳)氫化鈉，且將該反應混合物於室溫攪拌達 1 小時。然後添加 0.50 克(2.7 毫莫耳) 5-(2-第三丁基環氧乙烷-2-基)-1,3-噻唑且將該反應混合物於 100°C 攪拌達 12 小時。冷卻至室溫後，將溶劑於減壓下移除，且將飽和氯化鈉水溶液及醋酸乙酯添加至該殘質中。將有機相移除，於硫酸鈉上乾燥，過濾且濃縮。然後將粗

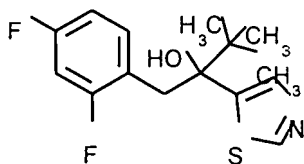
產物藉管柱色層分離法(3:1 環己烷/醋酸乙酯)予以純化。此得到 0.24 克(23%)想要的產物。

5-(2-第三丁基環氧乙烷-2-基)-1,3-噻唑之製備



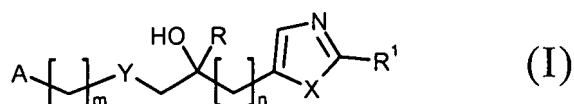
該製備係類似於 EP-A 0 409 418 中所說明之製法進行。

31 號化合物之製備(製法 A)



於溶解於 10 毫升二乙醚之 0.30 克(1.8 毫莫耳) 2,2-二甲基-1-(1,3-噻唑-5-基)丙-1-酮中，於 -10°C 氬氣壓下添加 21 毫升(0.25 M 於二乙醚中，5.3 毫莫耳) 2,4-二氟苄基溴化鎂，且將該反應混合物回暖至室溫。然後將該反應混合物於室溫攪拌達 12 小時。於添加飽和氯化銨水溶液後，將各相分離且將含水相用醋酸乙酯萃取。將合併的有機相於硫酸鈉上乾燥，過濾且濃縮。然後將該粗產物藉管柱色層分離法(5:1 環己烷/醋酸乙酯)予以純化。此得到 0.20 克(39%)想要的產物。

表 1



號碼	X	Y	m	n	R	R ¹	A	物理數據
1	S	O	0	0	tBu	H	2-氟-4-碘苯基	¹ H NMR : δ (400 MHz, DMSO-d ₆) = 0.98 (s, 9H) , 4.25 (d, J = 10 Hz, 1H) , 4.40 (d, J = 10 Hz, 1H) , 5.75 (s, 1H) , 7.07 (m, 1H) , 7.47 (m, 1H) , 7.57 (m, 1H) , 7.76 (s, 1H) , 8.93 (s, 1H) ppm .
2	S	O	0	0	tBu	H	4-溴-2-氟苯基	¹ H NMR : δ (400 MHz, DMSO-d ₆) = 0.97 (s, 9H) , 4.25 (d, J = 10 Hz, 1H) , 4.38 (d, J = 10 Hz, 1H) , 5.69 (s, 1H) , 7.17 (d, J = 9 Hz, 1H) , 7.48 (dd, J = 9 Hz, 2Hz, 1H) , 7.63 (d, J = 2 Hz, 1H) , 7.81 (s, 1H) , 8.92 (s, 1H) ppm .
3	S	O	0	0	tBu	H	4-溴-2-氟苯基	¹ H NMR : δ (400 MHz, DMSO-d ₆) = 0.98 (s, 9H) , 4.26 (d, J = 10 Hz, 1H) , 4.41 (d, J = 10 Hz, 1H) , 5.73 (s, 1H) , 7.22 (m, 1H) , 7.31 (m, 1H) , 7.47 (m, 1H) , 7.76 (s, 1H) , 8.92 (s, 1H) ppm .
4	S	O	0	0	tBu	H	4-氟-2-(甲基硫烷基)苯基	¹ H NMR : δ (400 MHz, DMSO-d ₆) = 1.00 (s, 9H) , 2.34 (s, 3H) , 4.18 (d, J = 10 Hz, 1H) , 4.37 (d, J = 10 Hz, 1H) , 5.60 (s, 1H) , 7.01 (d, J = 2 Hz, 1H) , 7.08 (m, 1H) , 7.14 (m, 1H) , 7.86 (s, 1H) , 8.92 (s, 1H) ppm .
5	S	O	0	0	tBu	H	2-氟-4-碘苯基	log P 4.14 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 438 .

號碼	X	Y	m	n	R	R ¹	A	物理數據
6	S	O	0	0	iPr	H	4-溴-2-氟苯基	¹ H NMR : δ (400 MHz, DMSO-d6) = 0.81 (d, 3H), 0.90 (d, 3H), 2.27 (七重峰, 1H), 4.15 (d, 1H), 4.22 (d, 1H), 5.80 (s, 1H), 7.18 (t, 1H), 7.29-7.35 (m, 1H), 7.51 (dd, 1H), 7.78 (s, 1H), 8.95 (s, 1H) ppm ;
7	S	O	0	0	MCP	H	3,5-二溴苯基	log P 4.03 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 434
8	S	O	0	0	iPr	H	4-溴-2-氟苯基	¹ H NMR : δ (400 MHz, DMSO-d6) = 0.81 (d, 3H), 0.91 (d, 3H), 2.36 (七重峰, 1H), 4.13 (d, 1H), 4.19 (d, 1H), 5.80 (s, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.47 (dd, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.82 (s, 1H), 8.94 (s, 1H) ppm ;
9	S	O	0	0	iPr	H	4-氟-2-(甲基硫烷基)苯基	¹ H NMR : δ (400 MHz, DMSO-d6) = 0.80 (d, 3H), 0.91 (d, 3H), 2.38 (七重峰, 1H), 2.41 (s, 3H), 4.05 (d, 1H), 4.13 (d, 1H), 5.75 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.08-7.13 (m, 2H), 7.85 (s, 1H), 8.93 (s, 1H) ppm ;
10	S	O	0	0	MCP	H	4-碘-2-甲基苯基	log P 3.88 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 416
11	S	O	0	0	MCP	H	4-溴-3-氟苯基	¹ H NMR : δ (400 MHz, DMSO-d6) = 0.1-0.18 (m, 1H), 0.28-0.38 (m, 1H), 0.85-0.95 (m, 1H), 0.95 (s, 3H), 0.95-1.03 (m, 1H), 4.28 (d, 1H), 4.49 (d, 1H), 5.70 (s, 1H), 6.96 (dd, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.85 (s, 1H), 8.98 (s, 1H) ppm
12	S	O	0	0	MCP	H	4-溴-3-氟苯基	log P 3.30 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 372, 374

號碼	X	Y	m	n	R	R ¹	A	物理數據
13	S	O	0	0	MCP	H	4-溴-3-(三氟甲基)苯基	log P 3.70 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 422 , 424
14	S	O	0	0	tBu	H	2-甲氧基-4-(三氟甲氧基)苯基	log P 3.70 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 392。
15	S	O	0	0	MCP	H	4-碘-3-硝基苯基	log P 3.11 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 447
16	S	O	0	0	tBu	H	3-氟-4-[(三氟甲基)硫烷基]苯基	log P 3.96 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 396。
17	S	O	0	0	tBu	H	3-甲基-4-(甲基磺醯)苯基	log P 2.21 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 370。
18	S	O	0	0	tBu	H	3-甲基-4-(甲基亞磺醯)苯基	log P 1.90 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 354。
19	S	O	0	0	tBu	H	2-甲基-4-[(三氟甲基)磺醯]苯基	log P 3.63 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 424。
20	S	O	0	0	tBu	H	2-甲氧基-4-[(三氟甲基)磺醯]苯基	log P 3.37 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 440。
21	S	O	0	0	tBu	H	3-氟-4-[(三氟甲基)硫烷基]苯基	Log P 4.31 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 412。
22	S	O	0	0	tBu	H	3-甲基-4-[(三氟甲基)硫烷基]苯基	log P 4.35 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 392。
23	S	O	0	0	tBu	H	2-甲基-4-[(三氟甲基)硫烷基]苯基	log P 4.43 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 392。
24	S	O	0	0	tBu	H	3-氟-4-(三氟甲氧基)苯基	log P 4.02 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 396。
25	S	O	0	0	tBu	H	4-氟-2-甲基苯基	log P 3.77 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 326。
26	S	O	0	0	tBu	H	4-氟-2-氟苯基	log P 3.37 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 330。
27	S	O	0	0	tBu	H	4-氟-3-甲基苯基	log P 3.74 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 326。
28	S	O	0	0	tBu	H	3-甲基-4-(甲基硫烷基)苯基	log P 3.63 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 338。
29	S	O	0	0	tBu	H	2-氟-4-(三氟甲氧基)苯基	log P 4.10 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 396。

號碼	X	Y	m	n	R	R ¹	A	物理數據
30	S	O	0	0	tBu	H	3-氯聯苯基-4-基	¹ H NMR : δ (400 MHz, DMSO-d ₆) = 1.04 (s, 9H), 4.29 (d, J = 10 Hz, 1H), 4.43 (d, J = 10 Hz, 1H), 5.73 (s, 1H), 7.27 (d, J = 9Hz, 1H), 7.34 (m, 1H), 7.44 (m, 2H), 7.61 (m, 3H), 7.71 (d, J = 2Hz, 1H), 7.87 (s, 1H), 8.94 (s, 1H) ppm。
31	S	-	0	0	tBu	H	2,4-二氟苯基	log P 3.04 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 298。
32	S	O	0	0	MCP	H	4-溴-2-氟苯基	log P 3.32 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 372, 374
33	S	O	0	0	tBu	H	2,4-二氟苯基	log P 3.84 ^[a]
34	S	O	0	0	tBu	H	2,4-二氟苯基	log P 2.98 ^[a]
35	S	O	0	0	MCP	H	4-溴-2-甲氧基苯基	log P 3.26 ^[a]
36	S	O	0	0	MCP	H	4-溴-3-甲氧基苯基	log P 3.16 ^[a]
37	S	O	0	0	tBu	H	4-氯-2-(三氟甲氧基)苯基	log P 3.96 ^[a]
38	S	O	0	0	TFCP	H	2-氟-4-碘苯基	
39	S	O	0	0	tBu	H	3,4-二氟苯基	log P 3.72 ^[a]
40	S	O	0	0	TFCP	H	4-溴-2-甲基苯基	
41	S	O	0	0	tBu	H	3-溴-4-(三氟甲氧基)苯基	log P 4.12 ^[a]
42	S	O	0	0	tBu	H	2-甲基-4-(三氟甲氧基)苯基	log P 4.12 ^[a]
43	S	-	0	1	CCP	Cl	2,4-二氟苯基	
1	S	O	0	0	tBu	H	2-氟-4-碘苯基	¹ H NMR : δ (400 MHz, DMSO-d ₆) = 0.98 (s, 9H), 4.25 (d, J = 10 Hz, 1H), 4.40 (d, J = 10 Hz, 1H), 5.75 (s, 1H), 7.07 (m, 1H), 7.47 (m, 1H), 7.57 (m, 1H), 7.76 (s, 1H), 8.93 (s, 1H) ppm。

號碼	X	Y	m	n	R	R ¹	A	物理數據
2	S	O	0	0	tBu	H	4-溴-2-氟苯基	¹ H NMR : δ (400 MHz, DMSO-d6) = 0.97 (s, 9H), 4.25 (d, J = 10 Hz, 1H), 4.38 (d, J = 10 Hz, 1H), 5.69 (s, 1H), 7.17 (d, J = 9 Hz, 1H), 7.48 (dd, J = 9 Hz, 2H, 1H), 7.63 (d, J = 2 Hz, 1H), 7.81 (s, 1H), 8.92 (s, 1H) ppm。
3	S	O	0	0	tBu	H	4-溴-2-氟苯基	¹ H NMR : δ (400 MHz, DMSO-d6) = 0.98 (s, 9H), 4.26 (d, J = 10 Hz, 1H), 4.41 (d, J = 10 Hz, 1H), 5.73 (s, 1H), 7.22 (m, 1H), 7.31 (m, 1H), 7.47 (m, 1H), 7.76 (s, 1H), 8.92 (s, 1H) ppm。
4	S	O	0	0	tBu	H	4-氟-2-(甲基硫烷基)苯基	¹ H NMR : δ (400 MHz, DMSO-d6) = 1.00 (s, 9H), 2.34 (s, 3H), 4.18 (d, J = 10 Hz, 1H), 4.37 (d, J = 10 Hz, 1H), 5.60 (s, 1H), 7.01 (d, J = 2 Hz, 1H), 7.08 (m, 1H), 7.14 (m, 1H), 7.86 (s, 1H), 8.92 (s, 1H) ppm。
5	S	O	0	0	tBu	H	2-氟-4-碘苯基	log P 4.14 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 438。
6	S	O	0	0	iPr	H	4-溴-2-氟苯基	¹ H NMR : δ (400 MHz, DMSO-d6) = 0.81 (d, 3H), 0.90 (d, 3H), 2.27 (七重峰, 1H), 4.15 (d, 1H), 4.22 (d, 1H), 5.80 (s, 1H), 7.18 (t, 1H), 7.29-7.35 (m, 1H), 7.51 (dd, 1H), 7.78 (s, 1H), 8.95 (s, 1H) ppm ;
7	S	O	0	0	MCP	H	3,5-二溴苯基	log P 4.03 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 434

號碼	X	Y	m	n	R	R ¹	A	物理數據
8	S	O	0	0	iPr	H	4-溴-2-氯苯基	¹ H NMR : δ (400 MHz, DMSO-d6) = 0.81 (d, 3H), 0.91 (d, 3H), 2.36 (七重峰, 1H), 4.13 (d, 1H), 4.19 (d, 1H), 5.80 (s, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.47 (dd, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.82 (s, 1H), 8.94 (s, 1H) ppm ;
9	S	O	0	0	iPr	H	4-氯-2-(甲基硫烷基)苯基	¹ H NMR : δ (400 MHz, DMSO-d6) = 0.80 (d, 3H), 0.91 (d, 3H), 2.38 (七重峰, 1H), 2.41 (s, 3H), 4.05 (d, 1H), 4.13 (d, 1H), 5.75 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.08-7.13 (m, 2H), 7.85 (s, 1H), 8.93 (s, 1H) ppm ;
10	S	O	0	0	MCP	H	4-碘-2-甲基苯基	log P 3.88 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 416
11	S	O	0	0	MCP	H	4-溴-3-氯苯基	¹ H NMR : δ (400 MHz, DMSO-d6) = 0.1-0.18 (m, 1H), 0.28-0.38 (m, 1H), 0.85-0.95 (m, 1H), 0.95 (s, 3H), 0.95-1.03 (m, 1H), 4.28 (d, 1H), 4.49 (d, 1H), 5.70 (s, 1H), 6.96 (dd, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.85 (s, 1H), 8.98 (s, 1H) ppm
12	S	O	0	0	MCP	H	4-溴-3-氯苯基	log P 3.30 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 372, 374
13	S	O	0	0	MCP	H	4-溴-3-(三甲基)苯基	log P 3.70 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 422, 424
14	S	O	0	0	tBu	H	2-甲氧基-4-(三氟甲氧基)苯基	log P 3.70 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 392。
15	S	O	0	0	MCP	H	4-碘-3-硝基苯基	log P 3.11 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 447
16	S	O	0	0	tBu	H	3-氟-4-[(三氟甲基)硫烷基]苯基	log P 3.96 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 396。
17	S	O	0	0	tBu	H	3-甲基-4-(甲基磺醯)苯基	log 數 P 2.21 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 370。

號碼	X	Y	m	n	R	R ¹	A	物理數據
18	S	O	0	0	tBu	H	3-甲基-4-(甲基亞磺醯)苯基	log P 1.90 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 354。
19	S	O	0	0	tBu	H	2-甲基-4-[(三氟甲基)磺醯]苯基	log P 3.63 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 424。
20	S	O	0	0	tBu	H	2-甲氧基-4-[(三氟甲基)磺醯]苯基	log P 3.37 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 440。
21	S	O	0	0	tBu	H	3-氯-4-[(三氟甲基)硫烷基]苯基	log P 4.31 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 412。
22	S	O	0	0	tBu	H	3-甲基-4-[(三氟甲基)硫烷基]苯基	log P 4.35 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 392。
23	S	O	0	0	tBu	H	2-甲基-4-[(三氟甲基)硫烷基]苯基	log P 4.43 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 392。
24	S	O	0	0	tBu	H	3-氯-4-(三氟甲氧基)苯基	log P 4.02 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 396。
25	S	O	0	0	tBu	H	4-氯-2-甲基苯基	log P 3.77 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 326。
26	S	O	0	0	tBu	H	4-氯-2-氟苯基	log P 3.37 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 330。
27	S	O	0	0	tBu	H	4-氯-3-甲基苯基	log P 3.74 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 326。
28	S	O	0	0	tBu	H	3-甲基-4-(甲基硫烷基)苯基	log P 3.63 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 338。
29	S	O	0	0	tBu	H	2-氯-4-(三氟甲氧基)苯基	log P 4.10 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 396。
30	S	O	0	0	tBu	H	3-氯聯苯基-4-基	¹ H NMR : δ (400 MHz, DMSO-d ₆) = 1.04 (s, 9H), 4.29 (d, J = 10 Hz, 1H), 4.43 (d, J = 10 Hz, 1H), 5.73 (s, 1H), 7.27 (d, J = 9Hz, 1H), 7.34 (m, 1H), 7.44 (m, 2H), 7.61 (m, 3H), 7.71 (d, J = 2Hz, 1H), 7.87 (s, 1H), 8.94 (s, 1H) ppm。
31	S	-	0	0	tBu	H	2,4-二氟苯基	log P 3.04 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 298。
32	S	O	0	0	MCP	H	4-溴-2-氟苯基	log P 3.32 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 372, 374

號碼	X	Y	m	n	R	R ¹	A	物理數據
33	S	O	0	0	tBu	H	2,4-二氟苯基	log P 3.84 ^[a]
34	S	O	0	0	tBu	H	2,4-二氟苯基	log P 2.98 ^[a]
35	S	O	0	0	MCP	H	4-溴-2-甲氧基苯基	log P 3.26 ^[a]
36	S	O	0	0	MCP	H	4-溴-3-甲氧基苯基	log P 3.16 ^[a]
37	S	O	0	0	tBu	H	4-氯-2-(三氟甲基)苯基	log P 3.96 ^[a]
38	S	O	0	0	TFCP	H	2-氯-4-碘苯基	
39	S	O	0	0	tBu	H	3,4-二氟苯基	log P 3.72 ^[a]

iPr = 異丙基，tBu = 第三丁基，DFMP = 1,3-二氟-2-甲基丙-2-基，CCP = 1-氯環丙基，FCP = 1-氟環丙基，MCP = 1-甲基環丙基，TFCP = 1-(三氟甲基)環丙基，CCP = 1-氯環丙基。

該 log P 值係根據 EEC Directive 79/831 Annex V.A8 藉由 HPLC (高效液體色層分析法)使用逆相管柱 (C 18)以下列的方法測定：

[a] 酸性範圍內之 LC-MS 係於 pH 2.7 用 0.1%水性甲酸及乙腈(含有 0.1%甲酸)作為洗提液而測定；線性梯度由 10%乙腈至 95%乙腈。

[b] 酸性範圍內之 LC-MS 係於 pH 2.3 用 0.1%水性磷酸及乙腈 (含有 0.1%磷酸)作為洗提液而測定；線性梯度由 10%乙腈 至 95%乙腈。

選擇實例之其他 NMR 數據

下列選擇實例之 ^1H NMR 數據係以 ^1H NMR 峰清單之型式註釋。於各信號峰時，首先列舉以 ppm 計之 δ 值且然後係括號中之信號強度，以間隔分開。所列舉之不同信號峰的 δ -信號強度值配對係以分號將彼此分開。因此，一個實例之峰清單係為下列之型式：

δ_1 (強度 1) ; δ_2 (強度 2) ; ; δ_i (強度 i) ; ; δ_n (強度 n)。

該溶劑其中所記錄之 NMR 光譜係於實例號碼之後及於 NMR 峰清單之前列舉於方括號中。以峰清單型式之 NMR 數據表示的詳細說明可於公開案"於專利申請案引述之 NMR 峰清單數據"(參見研究揭示內容資料庫號 564025, 2011, 2011 年 3 月 16 日或 <http://www.rdelectronic.co.uk/rd/free/RD564025.pdf>)中發現。

實例 33 [DMSO- D_6] 8.9252 (1.70) ; 7.8174 (1.99) ; 7.5363 (1.28) ; 7.5299 (1.35) ; 7.3763 (0.66) ; 7.3698 (0.61) ; 7.3541 (0.91) ; 7.3476 (0.85) ; 7.2447 (1.41) ; 7.2224 (1.01) ; 5.7075 (2.38) ; 4.4053 (0.78) ; 4.3804 (1.08) ; 4.2752 (1.06) ; 4.2503 (0.77) ; 3.3076 (15.73) ; 2.5109 (2.04) ; 2.5066 (3.68) ; 2.5022 (4.70) ; 2.4978 (3.29) ; 2.4935 (1.59) ; 1.0097 (16.00) ; 0.9766 (0.32) ; -0.0002 (0.55)

實例 34 [DMSO- D_6] 8.9306 (1.68) ; 7.7749 (1.98) ; 7.7738 (1.88) ; 7.2648 (0.56) ; 7.2549 (0.60) ; 7.2413 (0.68) ;

7.2360 (0.69) ; 7.2296 (0.52) ; 7.2170 (0.39) ; 7.2146 (0.39) ; 7.2067 (0.32) ; 6.9955 (0.36) ; 6.9931 (0.39) ; 5.7292 (2.49) ; 4.4182 (0.81) ; 4.3934 (1.05) ; 4.2526 (1.04) ; 4.2278 (0.80) ; 3.3064 (20.14) ; 2.5101 (2.51) ; 2.5059 (4.55) ; 2.5014 (5.86) ; 2.4971 (4.15) ; 2.4928 (2.04) ; 2.0856 (0.98) ; 0.9834 (16.00)

實例 35 [DMSO-D₆] 8.8319 (0.91) ; 8.8306 (0.83) ; 7.7553 (1.08) ; 7.7539 (0.98) ; 7.0090 (0.61) ; 7.0042 (0.65) ; 6.9249 (0.70) ; 6.9199 (0.72) ; 6.9139 (1.00) ; 5.4730 (0.53) ; 4.2354 (0.44) ; 4.2106 (0.56) ; 4.0778 (0.55) ; 4.0530 (0.43) ; 3.6439 (3.78) ; 3.1747 (16.00) ; 2.3756 (1.80) ; 2.3714 (3.19) ; 2.3669 (4.02) ; 2.3626 (2.79) ; 2.3583 (1.34) ; 1.2644 (2.79) ; 0.8283 (2.72)

實例 38 [DMSO-D₆] 9.0525 (1.82) ; 9.0512 (1.78) ; 7.9899 (1.92) ; 7.6233 (0.67) ; 7.6182 (0.70) ; 7.5966 (0.67) ; 7.5915 (0.71) ; 7.5079 (0.42) ; 7.5043 (0.52) ; 7.4865 (0.48) ; 7.4828 (0.58) ; 7.4782 (0.42) ; 7.1953 (0.57) ; 7.1732 (1.01) ; 7.1511 (0.51) ; 6.4388 (2.18) ; 4.5935 (0.42) ; 4.5675 (1.05) ; 4.5406 (0.99) ; 4.5145 (0.37) ; 3.3034 (161.71) ; 2.8902 (0.40) ; 2.7307 (0.34) ; 2.6690 (0.34) ; 2.5391 (0.82) ; 2.5088 (19.00) ; 2.5044 (34.29) ; 2.5000 (43.96) ; 2.4956 (30.41) ; 2.4912 (14.67) ; 1.9867 (0.64) ; 1.4345 (0.36) ; 1.3984 (16.00) ; 1.1749 (0.41) ; 1.0343 (0.40) ; 1.0215 (0.36) ; 1.0176 (0.36) ; 0.9072

(0.35) ; 0.9023 (0.35) ; 0.8941 (0.33) ; 0.8901 (0.40) ;
-0.0002 (2.98)

實例 39 [DMSO-D₆] 8.9293 (1.66) ; 8.9252 (1.50) ; 7.7499
(2.01) ; 7.7460 (1.81) ; 7.4968 (1.06) ; 7.4912 (1.04) ;
7.4745 (1.14) ; 7.4689 (1.09) ; 7.2936 (1.19) ; 7.2878
(1.73) ; 7.2812 (1.10) ; 6.9625 (0.67) ; 6.9567 (0.95) ;
6.9498 (0.63) ; 6.9402 (0.64) ; 6.9343 (0.87) ; 6.9274
(0.54) ; 5.7478 (2.18) ; 5.7423 (2.10) ; 4.4855 (0.85) ;
4.4811 (0.79) ; 4.4606 (1.02) ; 4.4563 (0.92) ; 4.2260
(1.00) ; 4.2216 (0.93) ; 4.2012 (0.86) ; 4.1966 (0.78) ;
3.3176 (23.07) ; 3.3121 (23.19) ; 2.5070 (8.01) ; 2.5028
(7.25) ; 1.4032 (6.86) ; 1.3977 (6.63) ; 0.9815 (16.00) ;
0.9767 (15.10) ; 0.0056 (0.33) ; -0.0002 (0.34)

實例 40 [DMSO-D₆] 9.0508 (0.67) ; 8.0110 (0.71) ; 7.3414
(0.77) ; 7.3223 (0.35) ; 6.3728 (0.86) ; 5.7461 (16.00) ;
3.4276 (0.38) ; 3.3103 (878.85) ; 3.2874 (8.38) ; 3.1792
(0.41) ; 2.6738 (0.79) ; 2.6694 (1.06) ; 2.6650 (0.82) ;
2.5393 (2.27) ; 2.5090 (57.98) ; 2.5048 (103.51) ; 2.5004
(131.54) ; 2.4960 (92.07) ; 2.4918 (44.88) ; 2.3315 (0.71) ;
2.3270 (0.91) ; 2.3223 (0.65) ; 2.1489 (1.89) ; -0.0002
(20.21) ; -0.0084 (0.67)

實例 41 [DMSO-D₆] 8.9346 (1.09) ; 7.7564 (1.50) ; 7.4376
(1.43) ; 7.4302 (1.65) ; 7.4267 (0.74) ; 7.4233 (0.68) ;
7.4037 (0.67) ; 7.4006 (0.68) ; 7.0487 (0.80) ; 7.0413

(0.77) ; 7.0260 (0.72) ; 7.0185 (0.71) ; 5.7665 (1.41) ;
4.5124 (0.83) ; 4.4875 (0.98) ; 4.2367 (0.96) ; 4.2117
(0.84) ; 3.3287 (8.45) ; 2.5106 (4.28) ; 2.5065 (8.31) ;
2.5022 (11.54) ; 2.4980 (8.03) ; 2.4938 (4.03) ; 0.9767
(16.00) ; -0.0002 (3.34)

實例 42 [DMSO-D₆] 8.9289 (1.63) ; 7.7418 (1.67) ; 7.1351
(0.39) ; 7.1130 (1.59) ; 7.0806 (1.15) ; 7.0598 (0.62) ;
5.7043 (2.43) ; 4.3361 (0.60) ; 4.3111 (1.15) ; 4.2759
(1.17) ; 4.2515 (0.63) ; 3.3230 (186.57) ; 3.3183 (185.48) ;
3.2963 (2.14) ; 2.6791 (0.65) ; 2.6748 (1.23) ; 2.6699
(1.77) ; 2.6658 (1.28) ; 2.5403 (2.60) ; 2.5233 (2.96) ;
2.5052 (190.70) ; 2.5011 (256.80) ; 2.4975 (177.76) ; 2.4670
(0.52) ; 2.3370 (0.65) ; 2.3324 (1.32) ; 2.3277 (1.67) ;
2.3232 (1.28) ; 1.9428 (5.19) ; 1.3353 (0.32) ; 1.2981
(0.34) ; 1.2589 (0.48) ; 1.2435 (0.53) ; 1.2354 (0.74) ;
1.0053 (16.00) ; 0.9754 (0.47) ; 0.9552 (0.33) ; 0.9115
(0.42) ; 0.8852 (1.24) ; 0.8412 (0.85) ; 0.1457 (0.33) ;
0.0080 (2.35) ; -0.0002 (85.85) ; -0.0085 (2.63) ; -0.1498
(0.38)

實例 43 [DMSO-D₆] 7.6729 (0.36) ; 7.6694 (0.37) ; 7.5753
(0.40) ; 7.5616 (2.54) ; 7.5578 (4.26) ; 7.5434 (2.41) ;
7.4583 (3.60) ; 7.4418 (0.57) ; 7.4379 (0.32) ; 7.4032
(1.47) ; 7.3995 (1.41) ; 7.3893 (1.26) ; 7.3856 (1.21) ;
6.7796 (0.55) ; 5.9223 (0.32) ; 5.9136 (0.35) ; 5.3362

(0.34) ; 5.2956 (3.46) ; 5.1833 (0.33) ; 5.1144 (0.36) ;
 4.0600 (0.54) ; 4.0517 (0.54) ; 3.4593 (1.60) ; 3.4360
 (1.76) ; 3.4159 (1.33) ; 3.3910 (1.46) ; 3.3496 (50.10) ;
 3.0106 (1.61) ; 2.9872 (1.44) ; 2.8750 (1.35) ; 2.8500
 (1.25) ; 2.5251 (0.35) ; 2.5220 (0.44) ; 2.5189 (0.51) ;
 2.5098 (9.60) ; 2.5070 (19.67) ; 2.5041 (26.50) ; 2.5011
 (19.54) ; 2.4983 (9.39) ; 1.3967 (16.00) ; 1.3859 (0.69) ;
 1.2709 (0.42) ; 1.2679 (0.40) ; 0.9610 (0.38) ; 0.9586
 (0.41) ; 0.9525 (0.66) ; 0.9433 (0.66) ; 0.9408 (0.75) ;
 0.9323 (0.64) ; 0.9171 (0.60) ; 0.9087 (0.71) ; 0.9066
 (0.75) ; 0.8977 (0.72) ; 0.8911 (0.36) ; 0.8886 (0.42) ;
 0.8798 (0.36) ; 0.7468 (0.40) ; 0.7374 (0.51) ; 0.7356
 (0.52) ; 0.7284 (0.79) ; 0.7196 (0.67) ; 0.7178 (0.70) ;
 0.7092 (0.46) ; 0.6315 (0.49) ; 0.6233 (0.60) ; 0.6205
 (0.61) ; 0.6141 (0.61) ; 0.6124 (0.65) ; 0.6056 (0.45) ;
 0.6026 (0.48) ; 0.5938 (0.33) ; -0.0002 (1.48)

【實施方式】

使用實例

實例 A: 禾白粉菌(*Blumeria graminis*)試驗(大麥)/保護性

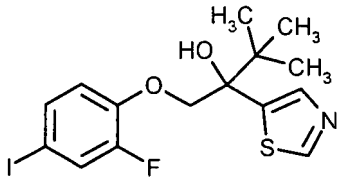
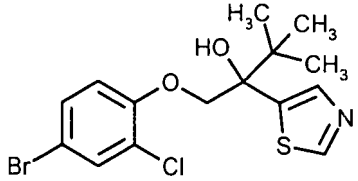
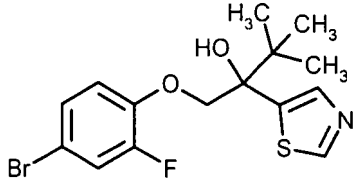
溶劑： 49 重量份之 N,N-二甲基乙醯胺

乳化劑： 1 重量份之烷基芳基聚乙二醇醚

為了製造適當的活性組成份製劑，將 1 重量份之活性組成份與指明數量之溶劑及乳化劑混合，且將該濃縮

物用水稀釋成想要的濃度。為了試驗保護活性，將植物幼株用活性組成份製劑以所說明之施用率予以噴灑。於噴灑塗層乾燥後，將該植物用大麥白粉菌(*Blumeria graminis* f.sp. *hordei*)之孢子噴撒。將該植物置於溫度約 18°C 及相對空氣濕度約 80%之溫室中以促進白粉病膿包生長。於接種後 7 天接著進行評估。0%意指相當於控制組之效率，而 100%效率意指沒有觀察到感染。於此試驗中，下列之本發明化合物，於活性組成份濃度 500 ppm 時，顯示 70%或更大之效率。

表 A：禾白粉菌試驗(大麥)/保護性

號碼	活性組成份	施用率(ppm)	效率(%)
1		500	100
2		500	100
3		500	100

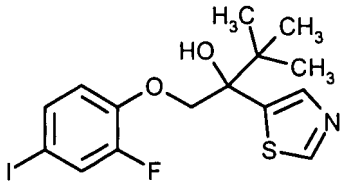
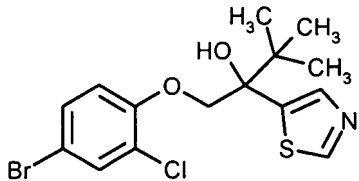
實例 B：穎枯小球腔菌試驗(小麥)/保護性

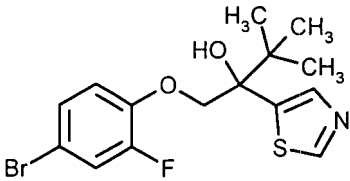
溶劑： 49 重量份之 N,N-二甲基乙醯胺

乳化劑：1 重量份之烷基芳基聚乙二醇醚

為了製造適當的活性組成份製劑，將 1 重量份之活性組成份與指明數量之溶劑及乳化劑混合，且將該濃縮物用水稀釋成想要的濃度。為了試驗保護活性，將植物幼株用活性組成份製劑以所說明之施用率予以噴灑。於噴灑塗層乾燥後，將該植物用穎枯小球腔菌之孢子懸浮液噴撒。將該植物保留於約 20°C 及相對空氣濕度 100% 之培育室中達 48 小時。將該植物置於溫度約 22°C 及相對空氣濕度約 80% 之溫室中。於接種後 8 天接著進行評估。0% 意指相當於控制組之效率，而 100% 效率意指沒有觀察到感染。於此試驗中，下列之本發明化合物，於活性組成份濃度 500 ppm 時，顯示 70% 或更大之效率。

表 B：穎枯小球腔菌試驗(小麥)/保護性

號碼	活性組成份	施用率(ppm)	效率(%)
1		500	100
2		500	92

號碼	活性組成份	施用率(ppm)	效率(%)
3		500	100

實例 C：小麥柄銹菌試驗(小麥)/保護性

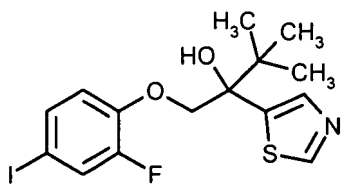
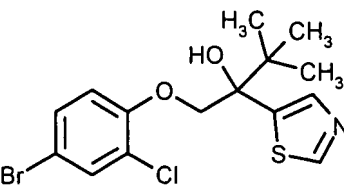
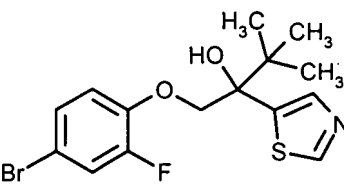
溶劑： 49 重量份之 N,N-二甲基乙醯胺

乳化劑： 1 重量份之烷基芳基聚乙二醇醚

為了製造適當的活性組成份製劑，將 1 重量份之活性組成份與指明數量之溶劑及乳化劑混合，且將該濃縮物用水稀釋成想要的濃度。為了試驗保護活性，將植物幼株用活性組成份製劑以所說明之施用率予以噴灑。於噴灑塗層乾燥後，將該植物用小麥柄銹菌之孢子懸浮液噴撒。將該植物保留於約 20°C 及相對空氣濕度 100% 之培育室中達 48 小時。將該植物置於溫度約 20°C 及相對空氣濕度約 80% 之溫室中。於接種後 8 天接著進行評估。0% 意指相當於控制組之效率，而 100% 效率意指沒有觀察到感染。於此試驗中，下列之本發明化合物，於活性組成份濃度 500 ppm 時，顯示 70% 或更大之效率。

表 C：小麥柄銹菌試驗(小麥)/保護性

號碼	活性組成份	施用率(ppm)	效率(%)
----	-------	----------	-------

號碼	活性組成份	施用率(ppm)	效率(%)
1		500	100
2		500	95
3		500	100

實例 D：單胞銹菌屬試驗(豆)/保護性

溶劑： 24.5 重量份之丙酮

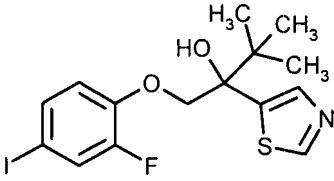
24.5 重量份之二甲基乙醯胺

乳化劑： 1 重量份之烷基芳基聚乙二醇醚

為了製造適當的活性組成份製劑，將 1 重量份之活性組成份與指明數量之溶劑及乳化劑混合，且將該濃縮物用水稀釋成想要的濃度。為了試驗保護活性，將植物幼株用活性組成份製劑以所說明之施用率予以噴灑。於噴灑塗層乾燥後，將該植物用豆銹病原體疣頂單胞銹菌之孢子水性懸浮液接種且然後置放於約 20°C 及相對空氣濕度 100% 之培育室中達 1 天。然後將該植物置於約 21°C 及相對空氣濕度約 90% 之溫室中。於接種後 10 天接著進行評估。0% 意指相當於控制組之效率，而 100%

效率意指沒有觀察到感染。於此試驗中，下列之本發明化合物，於活性組成份濃度 100 ppm 時，顯示 70%或更大之效率。

表 D：單胞銹菌屬試驗(豆)/保護性

號碼	活性組成份	施用率(ppm)	效率(%)
1		100	100

實例 E：黑星菌屬試驗(蘋果)/保護性

溶劑： 24.5 重量份之丙酮

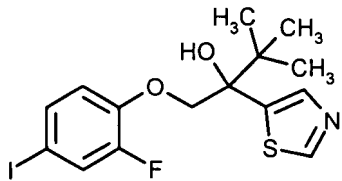
24.5 重量份之二甲基乙醯胺

乳化劑： 1 重量份之烷基芳基聚乙二醇醚

為了製造適當的活性組成份製劑，將 1 重量份之活性組成份與指明數量之溶劑及乳化劑混合，且將該濃縮物用水稀釋成想要的濃度。為了試驗保護活性，將植物幼株用活性組成份製劑以所說明之施用率予以噴灑。於噴灑塗層乾燥後，將該植物用蘋果斑點病原體蘋果黑星菌之分生孢子水性懸浮液接種且置放於約 20°C 及相對空氣濕度 100%之培育室中達 1 天。然後將該植物置於約 21°C 及相對空氣濕度約 90%之溫室中。於接種後 10 天接著進行評估。0%意指相當於控制組之效率，而 100%效率意指沒有觀察到感染。於此試驗中，下列之

本發明化合物，於活性組成份濃度 100 ppm 時，顯示 70%或更大之效率。

表 E：黑星菌屬試驗(蘋果)/保護性

號碼	活性組成份	施用率(ppm)	效率(%)
1		100	97

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：100118393

※申請日：100-5-26

※IPC 分類：

A01N^{43/18} (2006.01)

A01P^{3/00} (2006.01)

A01P^{21/00} (2006.01)

一、發明名稱：

新穎雜環烷醇衍生物

NOVEL HETEROCYCLIC ALKANOL DERIVATIVES

二、中文發明摘要：

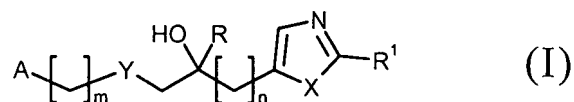
本發明係關於新穎之雜環烷醇衍生物，關於製備此等化合物的方法，關於包含此等化合物之組成物，及關於其等作為生物活性化合物之用途，特別於作物保護中及於物質保護中用來控制有害的微生物且作為植物生長調節劑。

三、英文發明摘要：

The present invention relates to novel heterocyclic alkanol derivatives, to processes for preparing these compounds, to compositions comprising these compounds and to their use as biologically active compounds, in particular for controlling harmful microorganisms in crop protection and in the protection of materials and as plant growth regulators.

十、申請專利範圍：

1. 一種式(I)雜環烷醇衍生物，



其中，

X 為 O 或 S，

Y 為 O、-CH₂-或直接鍵，

m 為 0 或 1，

n 為 0 或 1，

R 於各情況中為任意經取代之烷基、烯基、環烷基或芳基，

R¹ 為氫、SH、烷基硫基、烷氧基、鹵素、鹵烷基、鹵烷基硫基、鹵烷氧基、氰基、硝基或 Si(烷基)₃，

A 於各情況中為二-Z-經取代之苯基或萘基，其中二個取代基 Z 為相同或不同，

Z 為鹵素、氰基、硝基、OH、SH、C(烷基)(=NO 烷基)、C₃-C₇-環烷基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-鹵烷氧基、C₁-C₄-烷基硫基、C₁-C₄-鹵烷基硫基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-鹵烯基、C₂-C₄-炔基、C₂-C₄-鹵炔基、C₁-C₄-烷基亞磺醯基、C₁-C₄-鹵烷基亞磺醯基、C₁-C₄-烷基磺醯基、C₁-C₄-鹵烷基磺醯基、甲醯基、C₂-C₅-烷基羰基、C₂-C₅-鹵烷基羰基、

C₂-C₅-烷氧基羰基、C₂-C₅-鹵烷氧基羰基、C₃-C₆-烯基氧基、C₃-C₆-炔基氧基、C₂-C₅-烷基羰基氧基、C₂-C₅-鹵烷基羰基氧基、三烷基矽烷基，或於各情況中任意經鹵素、C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-鹵烷基-、C₁-C₄-烷氧基-或 C₂-C₄-烷基羰基-單取代之苯基、苯氧基或苯基硫基，

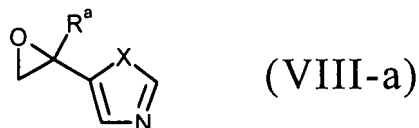
及其農化上活性之鹽類。

2. 如申請專利範圍第 1 項之式(I)雜環烷醇衍生物，其中
- X 為 O 或 S，
- Y 為 O、-CH₂-或直接鍵，
- m 為 0 或 1，
- n 為 0 或 1，
- R 於各情況中為任意分支的 C₃-C₇-烷基、C₁-C₈-鹵烷基、C₂-C₇-烯基、C₂-C₇-鹵烯基、任意經鹵素-、C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-鹵烷基-、C₁-C₄-烷氧基-、C₁-C₄-鹵烷氧基-、C₁-C₄-鹵烷基硫基-或 C₁-C₄-烷基硫基-取代之 C₃-C₇-環烷基，及任意經一-至三-鹵素-或-C₁-C₄-烷基-取代之苯基，
- R¹ 為氫、SH、C₁-C₄-烷基硫基、C₁-C₄-烷氧基或鹵素，
- A 於各情況中為二-Z-經取代之苯基、1-萘基或 2-萘基，其中二個取代基 Z 為相同或不同，

Z 為 鹵 素 、 氰 基 、 硝 基 、 C(C₁-C₅- 烷 基)(=NO(C₁-C₅- 烷 基))、 C₃-C₆-環 烷 基、 C₁-C₄- 烷 基、 C₁-C₄-鹵 烷 基、 C₁-C₄-烷 氧 基、 C₁-C₄-鹵 烷 氧 基、 C₁-C₄-烷 基 硫 基、 C₁-C₄-鹵 烷 基 硫 基、 C₂-C₄-烯 基、 C₂-C₄-炔 基、 C₁-C₄-烷 基 亞 磺 醯 基、 C₁-C₄-烷 基 磺 醯 基、 C₂-C₅-烷 基 羰 基、 C₂-C₅-烷 氧 基 羰 基、 C₃-C₆-烯 基 氧 基、 C₃-C₆-炔 基 氧 基、 C₂-C₅-烷 基 羰 基 氧 基， 或 於 各 情 況 中 任 意 經 鹵 素 -、 C₁-C₄-烷 基 -、 C₁-C₄-鹵 烷 基 -、 C₁-C₄-烷 氧 基 - 或 C₂-C₄-烷 基 羰 基 - 單 取 代 之 苯 基、 苯 氧 基 或 苯 基 硫 基。

3. 一種用於控制植物致病性有害真菌的方法，其特徵在於將如申請專利範圍第 1 或 2 項之式(I)雜環烷醇衍生物應用於植物致病性有害真菌及/或其等之棲息地。
4. 一種用於控制植物致病性有害真菌的組成物，其特徵在於含有至少一種如申請專利範圍第 1 或 2 項之式(I)雜環烷醇衍生物，以及增量劑及/或表面活化劑。
5. 如申請專利範圍第 4 項之組成物，其包括至少一種選自下列群組之其他活性組成份：殺昆蟲劑、誘捕劑、殺菌劑、殺細菌劑、殺蠕蟲劑、殺線蟲劑、殺真菌劑、生長調節劑、除草劑、肥料、安全劑及化學傳訊素。

6. 一種如申請專利範圍第 1 或 2 項之式(I)雜環烷醇衍生物於控制植物致病性有害真菌上之用途。
7. 一種如申請專利範圍第 1 或 2 項之式(I)雜環烷醇衍生物作為植物生長調節劑之用途。
8. 一種製造用於控制植物致病性有害真菌之組成物的方法，其特徵在於將如申請專利範圍第 1 或 2 項之式(I)雜環烷醇衍生物與增量劑及/或表面活化劑混合。
9. 一種如申請專利範圍第 1 項之式(I)雜環烷醇衍生物於處理基因轉殖植物之用途。
10. 一種如申請專利範圍第 1 項之式(I)雜環烷醇衍生物於處理種子及基因轉殖植物之種子的用途。
11. 一種式(VIII-a)環氧乙烷衍生物，



其中

X 為 O 或 S，

R^a 於各情況中為任意經取代之烷基(當 X 為 S 時，不包括第三丁基)、烯基、環烷基或芳基。

四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：無

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

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：

