

發明專利說明書

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※ 申請案號：93135510

※ 申請日期：93.11.19

※IPC 分類：A01N 37/18

一、發明名稱：(中文/英文)

矽烷基化之羧醯胺類

SILYLATED CARBOXAMIDES

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

拜耳作物科學股份有限公司

BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT

代表人：(中文/英文)

1. 包亞歷博士/DR. BADER, AXEL

2. 羅勃特博士/DR. KRIEG, ROBERT

住居所或營業所地址：(中文/英文)

德國莫罕城艾諾貝耳街 50 號

Alfred-Nobel-Strasse 50, 40789 Monheim, Germany

國 籍：(中文/英文)

德國/Germany

三、發明人：(共 8 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 杜洛夫/DUNKEL, RALF

2. 易漢斯/ELBE, HANS-LUDWIG

3. 哈賓特/HARTMANN, BENOIT

4. 柯艾德/KLAUSENER, ALEXANDER

5. 葛朱格/GREUL, JOERG NICO

6.瓦優克/WACHENDORFF-NEUMANN, ULRIKE

7.達彼得/DAHMEN, PETER

8.庫卡爾/KUCK, KARL-HEIN

國籍：(中文/英文)

1.、2. 和 4.~8. 均為德國/Germany

3.為法國/France

四、聲明事項：

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

☒ 申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

☒ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

德國；西元 2003 年 11 月 21 日；10354607.3

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

九、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於新穎的矽烷基化之羧醯胺類、其多種的製備法及其供防治不想要的微生物之用途。

5

【先前技術】

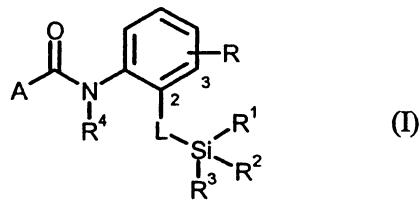
已知有無數的羧醯胺類具有殺真菌的性質(參考，例如，WO 03/080628、WO 03/010149、EP-A 0589 301、EP-A 0545 099)，這些化合物的活性很好；然而，有時候，例如在低施用比率下並不理想。

10

【發明內容】

本發明係關於一種式(I)之新穎的矽烷基化之羧醯胺類

15



其中

20

R 代表氫，氟，氯，甲基，異丙基，甲硫基或三氟甲基，
L 代表一個直接鍵或代表各為選擇地經取代的直鏈或分枝的伸烷基(烷二基)，伸烯基(烯二基)或伸炔基(炔二基)，

R^1 與 R^2 分別獨立地各自代表氫， C_1 - C_8 -烷基， C_1 - C_8 -烷氧基， C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基， C_1 - C_4 -烷硫基- C_1 - C_4 -烷基或 C_1 - C_6 -鹵素烷基，

R^3 代表氫， C_1 - C_8 -烷基， C_1 - C_8 -烷氧基， C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基， C_1 - C_4 -烷硫基- C_1 - C_4 -烷基， C_2 - C_8 -烯基， C_2 - C_8 -炔基， C_1 - C_6 -鹵素烷基， C_2 - C_6 -鹵素烯基， C_2 - C_6 -鹵素炔基， C_3 - C_6 -環烷基，或代表分別獨立地各為選擇地經取代的苯基或苯基烷基，

R^4 代表氫， C_1 - C_8 -烷基， C_1 - C_6 -烷基亞磺醯基， C_1 - C_6 -烷基磺醯基， C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基， C_3 - C_8 -環烷基；各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之 C_1 - C_6 -鹵素烷基， C_1 - C_4 -鹵素烷硫基， C_1 - C_4 -鹵素烷基亞磺醯基， C_1 - C_4 -鹵素烷基磺醯基，鹵素- C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基， C_3 - C_8 -鹵素環烷基；甲醯基，甲醯基- C_1 - C_3 -烷基，(C_1 - C_3 -烷基)羰基- C_1 - C_3 -烷基，(C_1 - C_3 -烷氧基)羰基- C_1 - C_3 -烷基；各帶有1至13個氟、氯及/或溴原子之鹵素-(C_1 - C_3 -烷基)羰基- C_1 - C_3 -烷基，鹵素-(C_1 - C_3 -烷氧基)羰基- C_1 - C_3 -烷基；(C_1 - C_8 -烷基)羰基，(C_1 - C_8 -烷氧基)羰基，(C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基)羰基，(C_3 - C_8 -環烷基)羰基；各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之(C_1 - C_6 -鹵素烷基)羰基，(C_1 - C_6 -鹵素烷氧基)羰基，(鹵素- C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基)羰基，(C_3 - C_8 -鹵素環烷基)羰基；或 $-C(=O)C(=O)R^5$ ， $-CONR^6R^7$ 或 $-CH_2NR^8R^9$ ，

R^5 代表氫， C_1-C_8 -烷基， C_1-C_8 -烷氧基， C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基， C_3-C_8 -環烷基；各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_6 -鹵素烷基， C_1-C_6 -鹵素烷氧基，鹵素- C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基， C_3-C_8 -鹵素環烷基，

5 R^6 與 R^7 彼此分別獨立地代表氫， C_1-C_8 -烷基， C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基， C_3-C_8 -環烷基；各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_8 -鹵素烷基，鹵素- C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基， C_3-C_8 -鹵素環烷基，

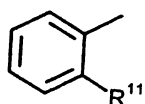
10 R^6 與 R^7 另外可與其被附接的氮原子一起形成具有5至8員環原子之飽和的雜環，其可選擇地經取代一或多個相同或相異的選自包括下列的取代基：鹵素與 C_1-C_4 -烷基，其中的雜環可再含有1或2個選自包括氧，硫與 NR^{10} 之非相鄰的雜原子，

15 R^8 與 R^9 彼此分別獨立地，代表氫， C_1-C_8 -烷基， C_3-C_8 -環烷基；各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_8 -鹵素烷基， C_3-C_8 -鹵素環烷基，

20 R^8 與 R^9 另外可與其被附接的氮原子一起形成具有5至8員環原子之飽和的雜環，其可選擇地經取代一或多個相同或相異的選自包括下列的取代基：鹵素與 C_1-C_4 -烷基，其中的雜環可再含有1或2個選自包括氧，硫與 NR^{10} 之非相鄰的雜原子，

R^{10} 代表氫或 C_1-C_6 -烷基，

A 代表式(A 1)之基



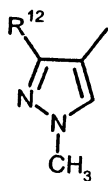
(A1)

其中

R^{11} 代表氫，鹵素，羥基，氰基， C_1 - C_6 -烷基，各帶有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵素烷基， C_1 - C_4 -鹵素
 5 烷氧基或 C_1 - C_4 -鹵素烷硫基，

或

A 代表式(A2)之基



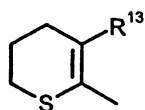
(A2)

其中

R^{12} 代表氯，碘或二氯甲基，

或

A 代表式(A3)之基



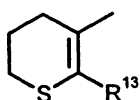
(A3)

其中

R^{13} 代表 C_1 - C_4 -烷基或帶有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 -
 鹵素烷基，

或

A 代表式(A4)之基



(A4)

其中

R^{13} 代表 C_1-C_4 -烷基或帶有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1-C_4 -鹵素烷基，

或

A 代表式(A5)之基

5



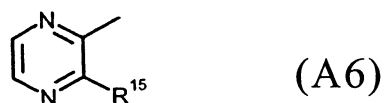
其中

R^{14} 代表 C_1-C_4 -烷基或帶有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1-C_4 -鹵素烷基，

10

或

A 代表式(A6)之基



其中

15

R^{15} 代表氫，鹵素， C_1-C_4 -烷基或帶有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1-C_4 -鹵素烷基，

或

A 代表式(A7)之基

20



其中

R^{16} 代表鹵素，羥基， C_1-C_4 -烷基， C_1-C_4 -烷氧基， C_1-C_4 -烷硫基，各帶有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1-C_4 -鹵素烷基， C_1-C_4 -鹵素烷硫基或 C_1-C_4 -鹵素烷氧基，

或

A 代表式(A8)之基

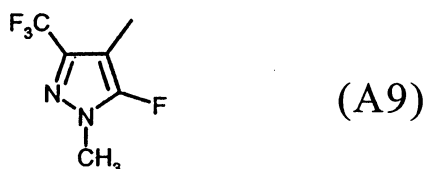


5 其中

R^{17} 代表 C_1 - C_4 -烷基，

或

A 代表式(A9)之基



10

或

A 代表式(A10)之基



15

X 代表 O(氧)或 S(硫)，

或

A 代表式(A11)之基



20

X 代表 O(氧)或 S(硫)，

R^{18} 代表碘或甲基。

根據本發明的化合物可以，如適當的話，為各種可能的異構物之混合物，特別是立體異構物，譬如，例如，E與Z、threo與erythro及光學異構物，且，適當的，也包括互變

異構物，本案所主張者包括E與Z及threo與erythro及光學異構物，任何這些異構物及可能的互變型之混合物。

此外已發現矽烷基化的式(I)之羧醯胺類可得自當

a) 式(II)之羧酸衍生物類

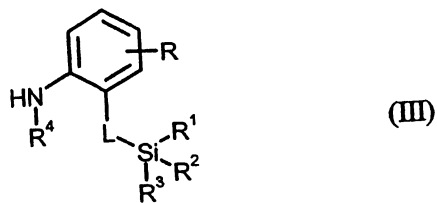


其中

X^1 代表鹵素或羥基且

A 的定義同前

被與式(III)的胺類反應

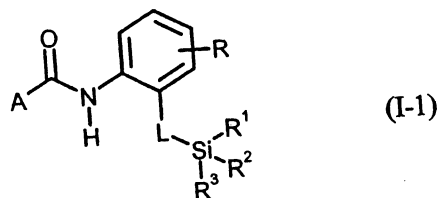


其中R，L， R^1 ， R^2 ， R^3 與 R^4 的定義同前，

係在適當的催化劑、適當的縮合劑、適當的酸結合劑及適當的溶劑存在下進行，

或

b) 式(I-1)之經矽烷基化的羧醯胺類



其中R，L， R^1 ， R^2 ， R^3 與 R^4 的定義同前，

被與式(VIII)的鹵化物反應



其中

X^2 代表氯，溴或碘，

R^{4a} 代表 C_1-C_8 -烷基， C_1-C_6 -烷基亞磺醯基， C_1-C_6 -烷基磺醯基， C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基， C_3-C_8 -環烷基；各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_6 -鹵素烷基， C_1-C_4 -鹵素烷硫基， C_1-C_4 -鹵素烷基亞磺醯基， C_1-C_4 -鹵素烷基磺醯基，鹵素- C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基， C_3-C_8 -鹵素環烷基；甲醯基，甲醯基- C_1-C_3 -烷基，(C_1-C_3 -烷基)羰基- C_1-C_3 -烷基，(C_1-C_3 -烷氧基)羰基- C_1-C_3 -烷基；各帶有1至13個氟、氯及/或溴原子之鹵素-(C_1-C_3 -烷基)羰基- C_1-C_3 -烷基，鹵素-(C_1-C_3 -烷氧基)羰基- C_1-C_3 -烷基；(C_1-C_8 -烷基)羰基，(C_1-C_8 -烷氧基)羰基，(C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基)羰基，(C_3-C_8 -環烷基)羰基；各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之(C_1-C_6 -鹵素烷基)羰基，(C_1-C_6 -鹵素烷氧基)羰基，(鹵素- C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基)羰基，(C_3-C_8 -鹵素環烷基)羰基；或 $-C(=O)C(=O)R^5$ ， $-CONR^6R^7$ 或 $-CH_2NR^8R^9$ ，其中 R^5 ， R^6 ， R^7 ， R^8 與 R^9 被定義於申請專利範圍第1項的主張中，

係在鹼與稀釋劑存在下進行。

最後，已發現，此式(I)之新穎的矽烷基化之羧醯胺類具有極好的制微生物性質，並可在作物保護與材料的保護兩方面被用於防治不想要的微生物。

5 式(I)代表根據本發明的矽烷基化之羧醯胺類之一般定義，展示如前面或後面的化學式中之較佳的基之定義如下之說明，這些定義適用於最後式(I)的化合物以及所有中間物之定義。

R 適宜代表氫。

10 R 也適宜代表氟，其中氟特別地適宜位於醯替苯胺基(anilide radical)之第4-，5-或6-位置，極適宜位於4-或6-位置，尤其是位於4-位置[參考上面之式(I)]。

R 也適宜代表氯，其中氯特別地適宜位於醯替苯胺基之5-位置[參考上面之式(I)]。

15 R 也適宜代表甲基，其中甲基特別地適宜位於醯替苯胺基之3-位置[參考上面之式(I)]。

R 也適宜代表三氟甲基，其中三氟甲基特別地適宜位於醯替苯胺基之4-或5-位置[參考上面之式(I)]。

20 L 適宜代表一個直接鍵或代表選擇地經鹵素-取代的直接鍵或分枝的C₁-C₆-伸烷基，C₂-C₆-伸烯基或C₂-C₆-伸炔基。

L 特別地適宜代表直接鍵或代表-CH₂-，-(CH₂)₂-，-(CH₂)₃-，-CH(Me)-，-CH(Me)CH₂-，-CH₂CH(Me)-，-CH(Me)CH(Me)-，-C(Me₂)CH₂-，-CH(Me)-(CH₂)₂-，-CH(Me)-(CH₂)₃-，-CH=CH-，-C(Me)=CH-或-C=C-。

L 極適宜代表 $-(\text{CH}_2)_2-$, $-(\text{CH}_2)_3-$, $-\text{CH}(\text{Me})-$,
 $-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$, $-\text{CH}(\text{Me})-(\text{CH}_2)_2-$, $-\text{CH}(\text{Me})-(\text{CH}_2)_3-$,
 $-\text{CH}=\text{CH}-$, $-\text{C}(\text{Me})=\text{CH}-$ 或 $-\text{C}=\text{C}-$.

5 R^1 與 R^2 分別各自獨立地, 適宜代表 C_1 - C_6 -烷基, C_1 - C_6 -烷
 氧基, C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基或 C_1 - C_3 -烷硫基- C_1 - C_3 -
 烷基。

10 R^1 與 R^2 分別各自獨立地, 特別地適宜代表甲基, 乙基,
 甲氧基, 乙氧基, 甲氧基甲基, 乙氧基甲基, 甲氧基
 乙基, 乙氧基乙基, 甲硫基甲基, 乙硫基甲基, 甲硫
 基乙基或乙硫基乙基。

R^1 與 R^2 分別各自獨立地, 極適宜代表甲基, 甲氧基, 甲
 氧基甲基或甲硫基甲基。

R^1 與 R^2 尤其適宜各代表甲基。

15 R^3 適宜代表 C_1 - C_6 -烷基, C_1 - C_6 -烷氧基, C_1 - C_3 -烷氧基
 $-\text{C}_1$ - C_3 -烷基, C_1 - C_3 -烷硫基- C_1 - C_3 -烷基, C_3 - C_6 -環烷
 基, 苯基或苯甲基。

20 R^3 特別地適宜代表甲基, 乙基, 正-或異丙基, 正-、第二
 -、異-或第三-丁基, 甲氧基, 乙氧基, 正-或異丙氧基,
 正-、第二-、異-或第三-丁氧基, 甲氧基甲基, 乙氧基
 甲基, 甲氧基乙基, 乙氧基乙基, 甲硫基甲基, 乙硫
 基甲基, 甲硫基乙基, 乙硫基乙基, 環丙基, 苯基或
 苯甲基。

R³ 極適宜代表甲基，乙基，正-或異丙基，異-或第三-丁基，甲氧基，異丙氧基，異-或第三-丁氧基，甲氧基甲基，甲硫基甲基或苯基。

R³ 尤其適宜代表甲基，乙基，正-或異丙基，異-或第三-丁基，甲氧基，異丙氧基，異-或第三-丁氧基。

R³ 最佳地適宜 代表甲基。

R⁴ 適宜代表氫，C₁-C₆-烷基，C₁-C₄-烷基亞磺醯基，C₁-C₄-烷基磺醯基，C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基，C₃-C₆-環烷基；各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之C₁-C₄-鹵素烷基，C₁-C₄-鹵素烷基硫基，C₁-C₄-鹵素烷基亞磺醯基，C₁-C₄-鹵素烷基磺醯基，鹵素-C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基，C₃-C₈-鹵素環烷基；甲醯基，甲醯基-C₁-C₃-烷基，(C₁-C₃-烷基)羰基-C₁-C₃-烷基，(C₁-C₃-烷氧基)羰基-C₁-C₃-烷基；各帶有1至13個氟、氯及/或溴原子之鹵素-(C₁-C₃-烷基)羰基-C₁-C₃-烷基，鹵素-(C₁-C₃-烷氧基)羰基-C₁-C₃-烷基；(C₁-C₆-烷基)羰基，(C₁-C₄-烷氧基)羰基，(C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基)羰基，(C₃-C₆-環烷基)羰基；各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之(C₁-C₄-鹵素烷基)羰基，(C₁-C₄-鹵素烷氧基)羰基，(鹵素-C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基)羰基，(C₃-C₆-鹵素環烷基)羰基；或-C(=O)C(=O)R⁵，-CONR⁶R⁷或-CH₂NR⁸R⁹。

R⁴ 特別地適宜代表氫，甲基，乙基，正-或異丙基，正-、異-、第二-或第三-丁基，戊基或己基，甲基亞磺醯基，乙基亞磺醯基，正-或異丙基亞磺醯基，正-、異-、第

二-或第三-丁基亞磺醯基，甲基磺醯基，乙基磺醯基，
 正-或異丙基磺醯基，正-、異-、第二-或第三-丁基磺醯
 基，甲氧基甲基，甲氧基乙基，乙氧基甲基，乙氧基
 乙基，環丙基，環戊基，環己基，三氟甲基，三氯甲
 基，三氟乙基，二氟甲硫基，二氟氯甲硫基，三氟甲
 硫基，三氟甲基亞磺醯基，三氟甲基磺醯基，三氟甲
 氧基甲基，甲醯基， $-\text{CH}_2\text{-CHO}$ ， $-(\text{CH}_2)_2\text{-CHO}$ ，
 $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_3$ ， $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$ ， $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}(\text{CH}_3)_2$ ，
 $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO-CH}_3$ ， $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$ ， $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO-CH}(\text{CH}_3)_2$ ，
 $\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CH}_3$ ， $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CHCH}_3$ ， $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ，
 $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}_3$ ， $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ ， $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ，
 $-\text{CH}_2\text{-CO-CF}_3$ ， $-\text{CH}_2\text{-CO-CCl}_3$ ， $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CF}_3$ ，
 $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CCl}_3$ ， $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO-CH}_2\text{CF}_3$ ， $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO-CH}_2\text{CCl}_3$ ，
 $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ ， $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ ， $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CCl}_3$ ，
 $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$ ， $(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ ， $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ ，
 $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CCl}_3$ ， $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$ ；甲基羰基，乙基
 羰基，正-丙基羰基，異丙基羰基，第三-丁基羰基，甲
 氧基羰基，乙氧基羰基，第三-丁氧基羰基，環丙基羰
 基；三氟-甲基羰基，三氟甲氧基羰基，或
 $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{R}^5$ ， $-\text{CONR}^6\text{R}^7$ 或 $-\text{CH}_2\text{NR}^8\text{R}^9$ 。

R^4 極適宜代表氫，甲基，甲氧基甲基，甲醯基，
 $-\text{CH}_2\text{-CHO}$ ， $-(\text{CH}_2)_2\text{-CHO}$ ， $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_3$ ，
 $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$ ， $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}(\text{CH}_3)_2$ ， $-\text{C}(=\text{O})\text{CHO}$ ，

-C(=O)C(=O)CH₃ , -C(=O)C(=O)CH₂OCH₃ , -C(=O)CO₂CH₃ ,
-C(=O)CO₂CH₂CH₃ 。

R⁴ 尤其適宜代表氫。

R⁵ 適宜代表氫，C₁-C₆-烷基，C₁-C₄-烷氧基，C₁-C₃-烷氧
5 基-C₁-C₃-烷基，C₃-C₆-環烷基；各帶有1至9個氟、氯及
/或溴原子之C₁-C₄-鹵素烷基，C₁-C₄-鹵素烷氧基，鹵素
-C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基，C₃-C₆-鹵素環烷基。

R⁵ 特別地適宜代表氫，甲基，乙基，正-或異丙基，第三-
10 丁基，甲氧基，乙氧基，正-或異丙氧基，第三-丁氧基，
甲氧基甲基，環丙基；三氟-甲基，三氟甲氧基。

R⁶與R⁷ 彼此獨立地適宜代表氫，C₁-C₆-烷基，C₁-C₃-烷氧
基-C₁-C₃-烷基，C₃-C₆-環烷基；各帶有1至9個氟、氯及
/或溴原子之C₁-C₄-鹵素烷基，鹵素-C₁-C₃-烷氧基
-C₁-C₃-烷基，C₃-C₆-鹵素環烷基。

15 R⁶與R⁷ 另外與其附接的氮原子適宜形成一具有5或6個環
原子之飽和的雜環，其係選擇地經取代一至四個相同
或相異的選自包括下的取代基：鹵素與C₁-C₄-烷基，其
中雜環可再含有選自下列的1或2個非相鄰的雜原子：
氧、硫與NR¹⁰。

20 R⁶與R⁷ 彼此獨立地，特別地適宜代表氫，甲基，乙基，正
-或異丙基，正-、異-、第二-或第三-丁基，甲氧基甲基，
甲氧基乙基，乙氧基甲基，乙氧基乙基，環丙基，環
戊基，環己基；三氟甲基，三氯甲基，三氟乙基，三
氟甲氧基甲基。

R^6 與 R^7 另外與其附接的氮原子一起特別地適宜形成一飽和的雜環，包括選自下列的基：嗎啉，硫嗎啉與六氫吡啶，其中的雜環可選擇地經取代一至四個相同或相異的選自包括下列的取代基：氟，氯，溴與甲基，其
5 中的六氫吡啶可在其第二個氮原子上經取代 R^{10} 。

R^8 與 R^9 彼此獨立地，適宜代表氫， C_1 - C_6 -烷基， C_3 - C_6 -環-烷基；各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之 C_1 - C_4 -鹵素烷基， C_3 - C_6 -鹵素環烷基。

R^8 與 R^9 另外與其附接的氮原子一起適宜形成一具有5或6
10 個環原子之飽和的雜環，其係選擇地經取代一或多個相同或相異的選自包括下的取代基：鹵素與 C_1 - C_4 -烷基，其中雜環可再含有選自下列的1或2個非相鄰的雜原子：氧、硫與 NR^{10} 。

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

R^8 與 R^9 另外與其附接的氮原子一起特別地適宜形成一飽和的雜環，包括選自下列的基：嗎啉，硫嗎啉與六氫吡啶，這些雜環可選擇地經取代一至四個，相同或相異的選自包括下列的取代基：氟，氯，溴與甲基，其
20 中的六氫吡啶可在其第二個氮原子上經取代 R^{10} 。

R^{10} 適宜代表氫或 C_1 - C_4 -烷基。

R¹⁰ 特別地適宜代表氫，甲基，乙基，正-或異丙基，正-、異-、第二-或第三-丁基。

A 適宜代表展示如上之A1，A2，A5或A7基之一。

A 也適宜代表A6，A10或A11基。

5 A 特別地適宜代表A1基。

A 也特別地適宜代表A2基。

A 也特別地適宜代表A5基。

A 也特別地適宜代表A6基。

A 也特別地適宜代表A7基。

10 A 也特別地適宜代表A10基。

A 也特別地適宜代表A11的基。

R¹¹ 適宜代表氫，氟，氯，溴，碘，羥基，氰基，C₁-C₄-烷基，各帶有1至5個氟、氯及/或溴原子之C₁-C₂-鹵素烷基，C₁-C₂-鹵素烷氧基或C₁-C₂-鹵素烷硫基。

15 R¹¹ 特別地適宜代表氫，氟，氯，溴，碘，羥基，氰基，甲基，乙基，正-丙基，異丙基，正-丁基，異丁基，第二-丁基，第三-丁基，二氟甲基，三氟甲基，二氟氯甲基，三氯甲基，三氟甲氧基，二氟甲氧基，二氟氯甲氧基，三氯甲氧基，三氟甲硫基，二氟甲硫基，二氟氯甲硫基或三氯甲硫基。

20 R¹¹ 極適宜代表 氫，氟，氯，溴，碘，甲基，二氟甲基，三氟甲基或三氯甲基。

R¹¹ 尤其適宜代表氯，溴，碘，甲基，二氟甲基或三氟甲基。

- 5 R^{12} 適宜代表碘。
- R^{12} 也適宜代表氯。
- R^{12} 也適宜代表二氯甲基。
- 5 R^{13} 適宜代表甲基，乙基或帶有1至5個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_2 -鹵素烷基。
- R^{13} 特別地適宜代表甲基，乙基，三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基或三氯甲基。
- R^{13} 極適宜代表甲基，三氟甲基，二氟甲基或三氯-甲基。
- 10 R^{14} 適宜代表甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1-C_2 -鹵素烷基。
- R^{14} 特別地適宜代表甲基，乙基，三氟甲基，二氟甲基，二氟-氯甲基或三氯甲基。
- R^{14} 極適宜代表甲基，三氟甲基，二氟甲基或三氯-甲基。
- R^{14} 尤其適宜代表甲基或三氯甲基。
- 15 R^{15} 適宜代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基或帶有1至5個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_2 -鹵素烷基。
- R^{15} 特別地適宜代表氫，氟，氯，溴，甲基或三氯-甲基。
- R_{16} 適宜代表氟，氯，溴，碘，羥基， C_1-C_4 -烷基，甲氧基，乙氧基，甲硫基，乙硫基，二氟甲硫基，三氟甲硫基，
- 20 各帶有1至5個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_2 -鹵素烷基或 C_1-C_2 -鹵素烷氧基。
- R^{16} 特別地適宜代表氟，氯，溴，碘，甲基，乙基，正-丙基，異丙基，正-丁基，異丁基，第二-丁基，第三-丁基，三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基，三氯甲基。

R^{16} 極適宜代表氟，氯，溴，碘，甲基，三氟-甲基，二氟甲基或三氯甲基。

R^{17} 適宜代表甲基，乙基，正-丙基或異丙基。

R^{17} 特別地適宜代表甲基或乙基。

5 X 適宜代表O(氧)。

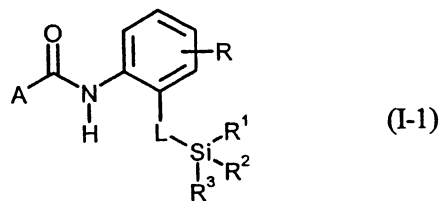
X 也適宜代表S(硫)。

R^{18} 適宜代表碘。

R^{18} 也適宜代表甲基。

另外被強調的是式(I-1)之化合物

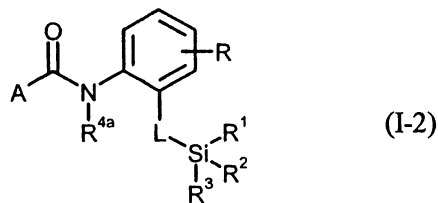
10



15 其中R，L， R^1 ， R^2 ， R^3 與A的定義同前。

另外被強調的是式(I-2)之化合物

20



其中R，L， R^1 ， R^2 ， R^3 ， R^{4a} 與A的定義同前。

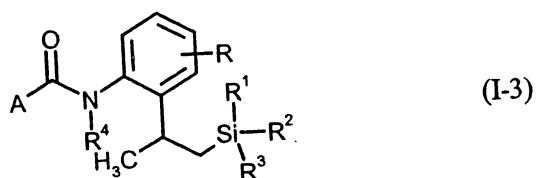
R^{4a} 適宜代表 C_1 - C_6 -烷基， C_1 - C_4 -烷基亞磺醯基， C_1 - C_4 -烷基磺醯基， C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基， C_3 - C_6 -環烷基；

各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之C₁-C₄-鹵素烷基，
 C₁-C₄-鹵素烷硫基，C₁-C₄-鹵素烷基-亞磺醯基，C₁-C₄-
 鹵素烷基磺醯基，鹵素-C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基，
 C₃-C₈-鹵素環烷基；甲醯基，甲醯基-C₁-C₃-烷基，(C₁-C₃-
 5 烷基)羰基-C₁-C₃-烷基，(C₁-C₃-烷氧基)羰基-C₁-C₃-烷
 基；各帶有1至13個氟、氯及/或溴原子之鹵素-(C₁-C₃-
 烷基)羰基-C₁-C₃-烷基，鹵素-(C₁-C₃-烷氧基)羰基
 -C₁-C₃-烷基；(C₁-C₆-烷基)羰基，(C₁-C₄-烷氧基)羰基，
 (C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基)羰基，(C₃-C₆-環烷基)羰基；
 10 各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之(C₁-C₄-鹵素烷基)
 羰基，(C₁-C₄-鹵素烷氧基)羰基，(鹵素-C₁-C₃-烷氧基
 -C₁-C₃-烷基)羰基，(C₃-C₆-鹵素環烷基)羰基；或
 -C(=O)C(=O)R⁵，-CONR⁶R⁷或-CH₂NR⁸R⁹，其中R⁵，R⁶，
 R⁷，R⁸與R⁹的定義同前。

15 R^{4a} 特別地適宜代表甲基，乙基，正-或異丙基，正-、異-、
 第二-或第三-丁基，戊基或己基，甲基亞磺醯基，乙基
 亞磺醯基，正-或異丙基亞磺醯基，正-、異-、第二-或
 第三-丁基亞磺醯基，甲基磺醯基，乙基磺醯基，正-
 或異丙基磺醯基，正-、異-、第二-或第三-丁基磺醯基，
 20 甲氧基甲基，甲氧基乙基，乙氧基甲基，乙氧基乙基，
 環丙基，環戊基，環己基，三氟甲基，三氯甲基，三
 氟乙基，二氟甲硫基，二氟氯甲硫基，三氟甲硫基，
 三氟甲基亞磺醯基，三氟甲基磺醯基，三氟甲氧基甲
 基；甲醯基，-CH₂-CHO，-(CH₂)₂-CHO，-CH₂-CO-CH₃，

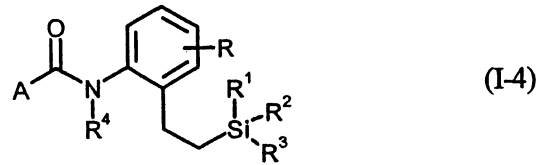
$-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}-\text{CH}_3$,
 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CH}_3$,
 $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CH}_3$,
 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CF}_3$,
 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CCl}_3$,
 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CF}_3$, $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$,
 $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$,
 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$, $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CCl}_3$,
 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$; 甲基羰基 , 乙基羰基 , 正-丙基
 羰基 , 異丙基羰基 , 第三-丁基羰基 , 甲氧基羰基 , 乙
 氧基羰基 , 第三-丁氧基羰基 , 環丙基羰基 , 三氟-甲基
 羰基 , 三氟甲氧基羰基 , 或 $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{R}^5$, $-\text{CONR}^6\text{R}^7$
 或 $-\text{CH}_2\text{NR}^8\text{R}^9$, 其中 R^5 , R^6 , R^7 , R^8 與 R^9 的定義如前。
 R^{4a} 極適宜代表甲基 , 甲氧基甲基 , 甲醯基 , $-\text{CH}_2-\text{CHO}$,
 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CHO}$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CH}_3$,
 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{CHO}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$,
 $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{OCH}_3$, $-\text{C}(=\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_3$, $-\text{C}(=\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 。

另外被強調的是式(I-3)之化合物



其中 R , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 與 A 的定義同前。

另外被強調的是式(I-4)之化合物



其中R，R¹，R²，R³，R⁴與A的定義同前。

飽和的或不飽和的烴基，例如烷基或烯基，各可為直鏈或分枝型式，只要有可能，包括，與雜原子之組合，例如，烷氧基中之型式。

選擇地經取代的基可以為單-或多-取代的型式，其中在多取代的情況，取代基可以是相同的或相異的基。

經鹵素取代的基，例如鹵素烷基，可以為單-或多-取代的型式，在多鹵素取代的情況，其中的鹵素原子可以為相同或不同，這兒所稱之鹵素，代表氟、氯、溴與碘，特別是氟、氯與溴。

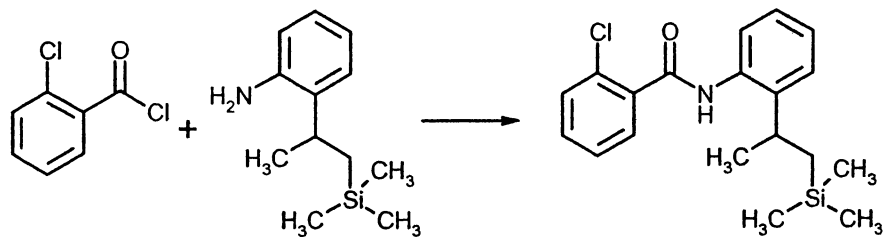
上述被定義成一般的與較佳的基或說明，有必要時可以在介於分別的範圍與較佳的範圍間混合，此定義也適用於最終產物與相關的前驅物及中間物。

製法與中間物的說明

製法 (a)

使用，例如，2-氯苯甲酰氯與{2-[1-甲基-2-(三甲基矽烷基)乙基]苯基}胺作為起始材料，根據本發明的製法(a)可用下面圖表予以說明。

5



10

式(II)代表被作為進行根據本發明的製法(a)之起始材料之羧酸衍生物的一般定義，在式(II)中，適宜地、特別適宜地與極適宜地的A之含義，分別相當於在說明式(I)的化合物時提及之適宜地、特別適宜地與極適宜地的基， X^1 適宜地代表氯，溴或羥基。

15

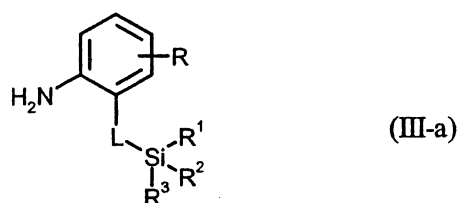
式(II)的羧酸衍生物類為已知及/或可藉由已知方法製備得者(參考，WO 93/11117，EP-A 0 545 099，EP-A 0 589 301，EP-A 0 589 313 與 DE-A 103 25 439.0)。

20

式(III)代表被作為進行根據本發明的製法(a)之另一起始材料之胺類的一般定義，在式(III)中，適宜地、特別適宜地與極適宜地，R，L， R^1 ， R^2 ， R^3 ， R^4 與A基之含義，分別相當於在說明式(I)的化合物時提及之適宜地、特別適宜地與極適宜地的基。

式(III)的胺類為已知及/或可藉由已知方法製備得者(參考，WO 03/080628 與製備實例)。

式(III)的胺類，其中 R^4 不代表氫者，可製自，例如，令式(III-a)的胺類



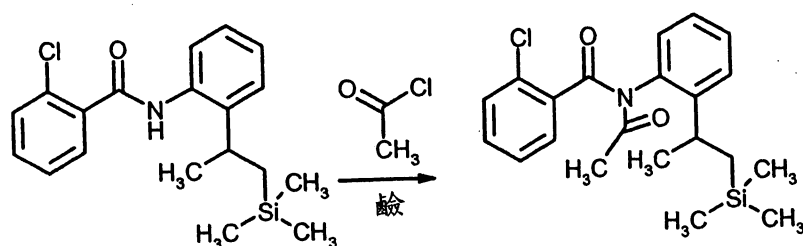
其中 R ， L ， R^1 ， R^2 與 R^3 的定義同前與式(VIII)的鹵化物反應



其中 X^2 與 R^{4a} 的定義同前[適用本發明製法(b)之相關反應條件]。

製法(b)

使用，例如，2-氯-N-{2-[1-甲基-2-(三甲基矽烷基)乙基]苯基}苯甲醯胺與乙醯基氯作為起始材料，根據本發明的製法(b)可用下面圖表予以說明。



式(I-a)代表被作為進行根據本發明的製法(b)之起始材料之矽烷基化的羧醯胺類的一般定義，在式(I-a)中，適宜地、特別適宜地與極適宜地，R，L，R¹，R²，R³與R⁴等基之含義，分別相當於在說明式(I)的化合物時提及之適宜地、特別適宜地與極適宜地的基。

式(I-1)的化合物為根據本發明的化合物且可根據製法(a)被製備得到。

反應條件

適於供進行根據本發明的製法(a)之稀釋劑類為所有的情性有機溶劑，這些適宜地包括脂肪族的、脂肪環族的或芳族的烴類，譬如，例如石油醚，己烷，庚烷，環己烷，甲基環己烷，苯，甲苯，二甲苯或十氫萘；鹵化的烴類，例如，氯苯，二氯苯，二氯甲烷，氯仿，四氯化碳，二氯乙烷或三氯乙烷；醚類，例如，二乙醚，二異丙基醚，甲基-第三-丁基醚，甲基第三-戊基醚，二噁烷，四氫呋喃，1,2-二甲氧基乙烷，1,2-二乙氧基乙烷或苯甲醚；腈類，例如乙腈，丙腈，正-或異丁腈或苯甲腈；醯胺類，例如，N,N-二甲基甲醯胺，N,N-二甲基乙醯胺，N-甲基甲醯苯胺，N-甲基吡咯酮或六甲基磷酸三醯胺；其等與水或純水之混合物。

適於供進行根據本發明的製法(b)之稀釋劑類為所有的情性有機溶劑，這些適宜地包括脂肪族的、脂肪環族的或芳族的烴類，譬如，例如石油醚，己烷，庚烷，環己烷，

甲基環己烷，苯，甲苯，二甲苯或十氫萘；鹵化的烴類，例如，氯苯，二氯苯，二氯甲烷，氯仿，四氯化碳，二氯乙烷或三氯乙烷；醚類，例如，二乙醚，二異丙基醚，甲基-第三-丁基醚，甲基第三-戊基醚，二噁烷，四氫呋喃，1,2-二甲氧基乙烷，1,2-二乙氧基乙烷或苯甲醚；醯胺類，例如，N,N-二甲基甲醯胺，N,N-二甲基乙醯胺，N-甲基甲醯苯胺，N-甲基吡咯酮或六甲基磷酸三醯胺。

根據本發明的製法(a)，適當地，是在適當的酸接受劑存在下進行，適當的酸接受劑為所有習用的無機或有機鹼類，較適宜者包括，鹼土金屬或鹼金屬的氫化物、氫氧化物、醯胺化物、醇化物、乙酸鹽、碳酸鹽或碳酸氫鹽類，例如，氫化鈉，醯胺化鈉，二異丙基醯胺化鋰，甲醇鈉，乙醇鈉，第三-丁氧基鉀，乙酸鈉，乙酸鉀，乙酸鈣，氫氧化鈉，氫氧化鉀，碳酸鈉，碳酸鉀，碳酸氫鉀，碳酸氫鈉或碳酸銨，以及三級胺類，例如，三甲基胺，三乙基胺，三丁基胺，N,N-二甲基苯胺，N,N-二甲基苯甲基胺，吡啶，N-甲基六氫吡啶，N-甲基嗎啉，N,N-二甲基胺基吡啶，二氮雜雙環辛烷(DABCO)，二氮雜雙環壬烯(DBN)或二氮雜雙環十一烯(DBU)。

根據本發明的製法(b)，適當地，是在適當的鹼存在下進行，適當的鹼為所有習用的無機或有機鹼類，較適宜者包括，鹼土金屬或鹼金屬的氫化物、氫氧化物、醯胺化物、醇化物、乙酸鹽、碳酸鹽或碳酸氫鹽類，例如，氫化鈉，醯胺化鈉，二異丙基醯胺化鋰，甲醇鈉，乙醇鈉，第三-丁

氧化鉀，乙酸鈉，乙酸鉀，乙酸鈣，乙酸銨，氫氧化鈉，
氫氧化鉀，碳酸鈉，碳酸鉀，碳酸氫鉀，碳酸氫鈉或碳酸
鈉，以及三級胺類，例如，三甲基胺，三乙基胺，三丁基
胺，N,N-二甲基苯胺，N,N-二甲基苯甲基胺，吡啶，N-甲
5 基六氫吡啶，N-甲基嗎啉，N,N-二甲基胺基吡啶，二氮雜
雙環辛烷(DABCO)，二氮雜雙環壬烯(DBN)或二氮雜雙環
十一烯(DBU)。

根據本發明的製法(a)，適當地，是在適當的縮合劑存
在下進行，適當的縮合劑為所有習被用於進行醯胺反應的
10 縮合劑，酸鹵化物形成劑，例如光氣，三溴化磷，三氯化
磷，五氯化磷，磷氧氯化物或硫醯氯；酸酐形成劑類，例
如，氯甲酸乙酯，氯甲酸甲酯，氯甲酸異丙基酯，氯甲酸
異丁基酯或甲磺醯基氯；碳二醯胺類，例如，N,N'-二環己
基碳二醯胺(DCC)或其他習用的縮合劑，例如五氧化二磷，
15 聚磷酸，N,N'-羰基二咪唑，2-乙氧基-N-乙氧基羰基-1,2-二
氫喹啉(EEDQ)，三苯基磷/四氯化碳或溴三吡咯啶基磷六氟
磷酸鹽，為值得順便一提者。

根據本發明的製法(a)，適當地，是在催化劑存在下進
行，可提及的實例為4-二甲基胺基吡啶，1-羥基苯並三唑或
20 二甲基甲醯胺。

進行根據本發明的製法(a)時，反應的溫度可在相當廣
的範圍間變化，通常，製法是在自0°C至150°C，宜為自0°C
至120°C間的溫度下，特別適宜的是在自10°C至80°C下進
行。

進行根據本發明的製法(b)時，反應的溫度可在相當廣的範圍間變化，通常，製法是在自0°C至150°C，宜為自20°C至110°C間的溫度下進行。

為製備式(I)的化合物而進行根據本發明的製法(a)時，通常對每莫耳的式(II)之羧酸衍生物，使用0.8至15莫耳，宜為0.8至8莫耳的式(III)之胺與自1至3莫耳的酸結合劑。

進行根據本發明的製法(b)時，通常對每莫耳的式(I-1)之矽烷基化的羧醯胺，使用0.2至5莫耳，宜為0.5至2莫耳的式(a)之鹵化物。

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

根據本發明的化合物具有強有力的制微生物的活性，就作物保護與材料保護方面，可被應用以防治不想要的微生物，例如真菌與細菌。

作為殺真菌劑類，可被應用於控制下列真菌以保護作物：根腫菌綱(Plasmodiophoromycetes)、卵菌綱(Oomycetes)、壺菌綱(Chytridiomycetes)、接合菌綱(Zygomycetes)、子囊菌綱(Ascomycetes)、擔子菌綱(Basidiomycetes)與不完全菌綱(Deuteromycetes)。

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

在上述學名下的可造成真菌與細菌性疾病之一些病原菌，可予舉例說明如下，但不限於這些而已：

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

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

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

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

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

15 假霜霉菌(*Pseudoperonospora species*)，例如蓴草假霜霉(*Pseudoperonospora humuli*)或瓜類露菌(*Pseudoperonospora cubensis*)；

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

盤梗霉(*Bremia species*)，例如卵苣盤梗霉(*Bremia lactucae*)；

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

白粉菌(*Erysiphe species*)，例如禾白粉菌；

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

鏈格孢菌屬 (*Alternaria species*)，例如薹薹輪紋病菌 (*Alternaria brassicae*)；與

Pseudocercospora 諸種，例如 *Pseudocercospora herpotrichoides*，

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

根據本發明的活性化合物對於植物也顯現有極佳的防禦作用，因此，它們適於供固定植物內部的防禦以對抗不想要的微生物之攻擊。

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

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

5 在需用來控制植物疾病的濃度下，植物對活性化合物具有良好的耐性之事實下，故活性化合物能被用來處理地表上的植物部分、繁殖用的莖桿與種子、以及土壤。

10 使用根據本發明的活性化合物用於控制穀物疾病具有特別好的效果，例如，用於對抗銹菌(*puccinia species*)，以及用於對抗發生於葡萄、蔬果栽培方面的疾病，例如對抗灰黴菌、黑星菌與鏈格孢菌。

根據本發明的活性化合物也適於增加作物的產量，此外，它們顯示對植物具較低的毒性與較好的耐受性。

15 適當地，根據本發明的化合物，在某一濃度與施用率下，也可作為除草劑，供調節植物生長與防治動物有害生物，適當地，它們也可被作為中間物與前驅物用於合成另外的活性化合物類。

20 根據本發明，有可能處理植物的全部或部分，可了解的，所稱之植物是指包括所有植物及植物族群，例如所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)，作物植物可以是得自傳統的育種與馴化方式或是藉由生物技術與基因工程方法或併用這些方法而得，包括基因轉殖植物與包括能或不能被植物育種者認證保護之植物栽培品種；植物的部位是指所有植物位於地表上的與

位於地表下的部位與器官，例如筍、葉、花與根，可提及者例如，葉子、針葉、莖、樹桿、花、果實體、果實與種子，以及根、球根與匍匐莖，植物的部位也包括被收割的材料與生長著的與繁殖用的材料，例如籽苗、塊莖、匍匐莖、插枝與種子。

根據本發明以活性化合物處理植物與植物的部分之進行方式，係根據習用的處理方式，直接地或作用其環境、生活環境或儲存地帶，例如使用浸泡、噴灑、蒸發、霧化、撒佈、刷上及，對於繁殖用材料，特別是種子，可進行一或多重的塗覆法。

作為保護材料方面，本發明的化合物類可被用於保護工業材料以對抗不想要的微生物之感染及摧毀。

本說明文中所稱的工業材料是指被製備供工業使用的無生命的材料，例如，想以本發明的活性化合物類保護免於微生物的改變或催毀者，可以是粘著劑類，上漿劑類，紙與卡紙，織品，皮革，木頭，塗料與塑膠物品，冷卻用潤滑劑類及其他的可被微生物感染或催毀的材料，製造工廠的零件，例如可能因微生物之增殖而損壞之冷卻-水循環系統也涵蓋於本範圍中，本發明範圍中的工業材料可提及者宜為粘著劑類，上漿劑類，紙與卡紙，皮革，木頭，塗料，冷卻的潤滑劑類與熱-交換液體，特別宜用於保護木頭。

可提及之可降解或改變工業材料的微生物類為，例如細菌，真菌，酵母菌，藻類與粘液菌等，根據本發明的活

性化合物宜作用對抗真菌，特別是黴菌類、使木頭褪色及催毀木頭之真菌(擔子菌綱)、與對抗粘液菌類與藻類。

可被舉例說明的微生物如下：

交鏈孢菌屬(*Alternaria*)，例如 *Alternaria tenuis*，

5 麴菌屬(*Aspergillus*)，例如黑麴菌(*Aspergillus niger*)，

毛殼菌屬(*Chaetomium*)，例如球毛殼(*Chaetomium globosum*)，

粉孢革菌屬(*Coniophora*)，例如粉孢革菌(*Coniophora puetana*)，

10 香菇屬(*Lentinus*)，例如虎皮香菇(*Lentinus tigrinus*)，

青黴菌屬(*Penicillium*)，例如藍色青黴菌(*Penicillium glaucum*)，

多孔革菌屬(*Polyporus*)，例如變色多孔菌(*Polyporus versicolor*)，

15 *Aureobasidium*菌屬，例如 *Aureobasidium pullulans*，

*Sclerophoma*菌屬，例如 *Sclerophoma pityophila*，

*Trichoderma*菌屬，例如 *Trichoderma viride*，

艾歇利希菌屬(*Escherichia*)，例如大腸桿(*Escherichia coli*)，

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

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

視其特殊的物理及/或化學性質，活性化合物可被轉變成習用的調配劑，例如溶液類，懸浮劑類，粉劑，泡沫劑，膏劑，粒劑，氣溶液與置於聚合性物質內的微膠囊劑與供種子塗覆的組成物，與ULV冷及溫霧化調配劑類。

- 5 這些調配劑係以已知的方式製備，例如將活性化合物混合展延劑，即，液態溶劑類，加壓下的液化之氣體，及/或固體載劑，選擇地配合使用界面活性劑，即，乳化劑及/或分散劑，及/或泡沫形成劑，如果使用的展延劑為水時，也可應用，例如有機溶劑作為輔助溶劑類，基本上，適當的液態溶劑類為：芳族類，例如二甲苯、甲苯或烷基苯類；
10 氯化的芳族類或氯化的脂肪族烴類，例如，氯苯類、氯乙烯類或二氯甲烷；脂肪族烴類，例如環己烷或石蠟類，例如石油分劃物；醇類，例如丁醇或甘醇以及其醚類與酯類；
15 酮類，例如丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁基酮或環己酮；強極性溶劑類，例如二甲基甲醯胺與二甲亞砷；或水。液化的氣體展延劑類或載劑是指在標準的溫度與壓力下為氣體之液體，例如氣溶液噴射劑類，例如鹵化的烴類，或是丁烷，丙烷，氮氣與二氧化碳，適當的固體載劑為：例如研細的天然礦物類，例如高嶺土、粘土、滑石、白堊土、
20 石英、美國活性白土、蒙脫土或矽藻土以及研細的合成礦物類，例如高度分散的二氧化矽，氧化鋁與矽酸鹽類；適於製備顆粒體之固態載劑為，例如，碾碎並分劃過的天然岩石，如，方解石、大理石、輕石、海泡石與白雲石，或合成之有機與無機配料之顆粒，與有機材料顆粒，例如，

鋸屑、椰子殼、玉米穗軸與菸草莖；適當的乳化用及/或泡沫-形成劑為：例如，非離子與陰離子的乳化劑類，例如聚氧乙烯脂肪酸酯類，聚氧乙烯脂肪族醇醚類，例如，烷基芳基聚甘醇醚類、烷基磺酸鹽類、烷基硫酸鹽類、芳基磺酸鹽類，或蛋白水解產物；適當的分散劑為：例如，木質素亞硫酸廢液與甲基纖維素。

粘著劑類，例如，羧甲基纖維素與天然與合成的聚合物類，呈粉狀、粒狀或乳膠態者，例如，阿拉伯膠、聚乙烯醇與聚乙烯醋酸酯，或天然磷脂質類，如腦磷脂與卵磷脂與合成的磷脂質類，均可被加於調配劑中，其他可能的添加物為礦物油類與植物油類。

也有可能用及著色劑，例如，無機色素類，例如，氧化鐵，二氧化鈦與普魯士藍，及有機染料，例如，茜素染料，偶氮類染料與金屬酞花青染料，以及微量營養成分，例如鐵、錳、硼、銅、鈷、鉬與鋅等的鹽類。

調配劑中通常包含介於0.1與95%重量計的活性化合物，宜為介於0.5與90%間者。

根據本發明的活性化合物，可以其原態或呈調配劑型態被使用，也可與其他已知的殺真菌劑類，殺細菌劑類，殺蟎劑類，殺線蟲劑類或殺昆蟲劑類成混合物被使用，用於增廣其活性譜或預防發展出抗性，於許多的情況中，可得到增效的效果，即，混合物的活性要大於各個個別組分的活性之和。

適於作為混合的組分，例如，下述的化合物：

殺真菌劑類：

2-苯基苯酚；8-羥基喹啉硫酸鹽；acibenzolar-S-甲基；
 阿得摩福(aldimorph)；醯胺福美特(amidoflumet)；安丙基松
 (ampropylfos)；安丙基松-鉀(ampropylfos-potassium)；安多
 5 普明(andoprim)；苯胺精(anilazine)；氮雜克唑
 (azaconazole)；阿唑昔唑丙(azoxystrobin)；本達樂
 (benalaxyl)；本達尼(benodanil)；免賴得(benomyl)；本札馬
 克基-異丙基(benzamacryl-isopropyl)；本札馬克利
 (benzamacril)；本札馬克基-異丁基(benzamacryl- isobutyl)；
 10 白阿松(bialaphos)；白那巴克(binapacryl)；聯苯(biphenyl)；
 比多農(bitertanol)；保米黴素-S；溴克利(bromuconazole)；
 布瑞莫(bupirimate)；得滅多(buthiobate)；丁基胺；聚硫化
 鈣；卡布辛黴素(capsimycin)；四氯丹(captafol)；蓋普丹
 (captan)；貝芬替(carbendazim)；卡保信(carboxin)；卡普米
 15 (carpropamid)；卡風(carvon)；(chinomethionat)；氯本塞宗
 (chlobenthiazole)；氯芬唑(chlorfenazole)；氯尼布
 (chloroneb)；氯塞尼(chlorothalonil)；氯唑林特
 (chlozolate)；克吉隆(clozylacon)，西唑發米(cyazofamid)；
 西氟芬米(cyflufenamid)；西莫辛尼(cymoxanil)；西普克唑
 20 (cyproconazole)；西普地尼(cyprodinil)；西普扶喃
 (cyprofuram)；Dagger G；地百克(debacarb)；二氯氟尼
 (dichlofluanid)；二克隆(dichlone)；二氯芬(dichlorophen)；
 二環美(diclocymet)；得克滅精(diclomezine)；大克爛
 (dicloran)；二硫芬克(diethofencarb)；待芬克力

(difenoconazole)；待富美多(diflumetorim)；得滅利莫(dimethirimol)；大滅芬(dimethomorph)；大滅唑丙(dimoxystrobin)；得尼克唑(diniconazole)；得尼克唑-M；大那克(dinocap)；二苯基胺；二比松(dipyrithion)；普得松(ditalimfos)；二硫琨(dithianon)；多寧(dodine)；得唑隆(drazoxolon)；護粒松(edifenphos)；環氧克唑(epoxiconazole)；依塞波辛(ethaboxam)，依瑞莫(ethirimol)；依得力(etridiazole)；芬莫沙動(famoxadone)；芬那米動(fenamidone)；芬那普尼(fenapanil)；芬瑞莫(fenarimol)；芬布克唑(fenbuconazole)；芬富南(fenfuram)；芬赫米(fenhexamid)；芬尼唑盆(fenitropan)；芬諾克山尼(fenoxanil)；芬畢克尼(fenpiclonil)；芬普比汀(fenpropidin)；芬普福(fenpropimorph)；富爾邦(ferbam)；伏寄南(fluzinam)；伏本吉明(flubenzimine)；伏地噁尼(fludioxonil)；伏美多法耳(flumetover)；富莫芬(flumorph)；富羅邁(fluoromide)；伏沙唑丙(fluoxastrobin)；富快克唑(fluquinconazole)；伏嘜多(flurprimidol)；護矽唑(flusilazole)；福磺醯胺(flusulfamide)；福多寧(flutolanil)；福採扶(flutriafol)；富皮特(folpet)；福賽得-鋁(fosetyl-Al)；福賽得-鈉(fosetyl-sodium)；福利達唑(fuberidazole)；福達樂(furalaxyl)；福滅比(furametpyr)；福卡波尼(furcarbonil)；福滅克斯(furmecyclox)；克熱淨(guazatine)；六氯苯；菲克斯(hexaconazole)；殺紋寧(hymexazol)；依滅列(imazalil)；印本克唑(imibenconazole)；亞胺基八丁三乙酸鹽

(iminooctadine triacetate) ; 亞胺基八丁三(阿伯昔)((iminooctadine tris(albesil)); 埃多克(iodocarb); 埃培克唑(ipconazole); 丙基喜樂松(IBP); 依普同(iprodione); 依普伐克(iprovalicarb); 依魯馬黴素(irumamycin); 亞賜圃(isoprothiolane); 異戊二酮(isovaledione); 嘉賜黴素(kasugamycin); 克雷索辛-甲基(kresoxim-methyl); 鋅錳乃浦(mancozeb); 錳乃浦(maneb); 滅非林宗(meferimzone); 滅盤尼比(mepanipyrim); 滅普寧(mepronil); 滅達樂(metalaxyl); 滅達樂-M; 滅克唑(metconazole); 滅速克(methasulfocab); 滅扶連(methfuroxam); 免得爛(metiram); 滅多明索丙(metominostrobin); 滅硫斯(metsulphovax); 邁地奧黴素(mildiomycin); 邁克別尼(myclobutanil); 邁克唑林(myclozolin); 那他黴素(natamycin); 尼克比芬(nicobifen); 硝基塞-異丙基(nitrothal-isopropyl); 諾維富門(noviflumuron); 尼瑞莫(nuarimol); 歐扶斯(ofurace); 歐沙唑賓(orysatrobin); 歐殺斯(oxadixyl); 歐林酸(oxolinic acid); 歐波克唑(oxpoconazole); 嘉保信(oxycarboxin); 歐芬辛素(oxyfenthiin); 北克丁唑(paclobutrazole); 平福唑(pefurazoate); 平克唑(penconazole); 賓克隆(pencycuron); 磷二芬(phosdiphen); 飛塞得(phthalide); 皮克辛多丙(picoxystrobin); 派拉寧(piperalin); 保粒黴素(polyoxins); 聚俄克林(polyoxorim); 撲殺熱(probenazole); 撲拉克(prochloraz); 撲滅寧(procymidone); 普拔克(propamocarb); 普朋辛-鈉(propanosine-sodium); 普克利(propiconazole); 甲

基鋅乃浦(propineb)；普快吉得(proquinazid)；普硫克唑
 (prothioconazole)；普克斯多丙(pyraclostrobin)；白粉松
 (pyrazophos)；必芬諾克(pyrifenoxy)；必滅寧(pyrimethanil)；
 百快隆(pyroquilon)；普克西伏(pyroxyfur)；比咯奈純
 5 (pyrrolenitrine)；快克唑(quinconazole)；快諾絲芬
 (quinoxifen)；快多淨(quintozone)；辛克唑(simeconazole)；
 司比羅克胺(spiroxamine)；硫；得克力(tebuconazole)；得克
 安(tecloftalam)；得那淨(tecnazene)；四環拉西(tetcyclacis)；
 四克唑(tetraconazole)；腐絕(thiabendazole)；硫安芬
 10 (thicyofen)；塞氟醯胺(thifluzamide)；甲基-多保淨
 (thiophanate-methyl)；得恩地(thiram)，太歐西米(tioxymid)；
 甲基-脫克松(toclophos-methyl)；甲苯氟尼得(tolyfluanid)；
 三泰芬(triadimefon)；三泰隆(triadimenol)；三雜別提
 (triazbutil)；三唑地(triazoxide)；三環醯胺(tricyclamide)；
 15 三賽唑(tricyclazole)；三得芬(tridemorph)；賽福西唑丙
 (trifloxystrobin)；賽福米唑(triflumizole)；賽福寧(triforine)；
 三地克唑(triticonazole)；優尼克唑(uniconazole)；維利黴素
 A(validamycin A)；文克唑寧(vinclozolin)；鋅乃浦(zineb)；
 鋅來(ziram)；唑查醯胺(zoxamide)；(2S)-N-[2-[4-[[3-(4-氯
 20 苯基)-2-丙炔基]氧]-3-甲氧基苯基]乙基]-3-甲基-2-[(甲基磺
 醯基)胺基]丁烷醯胺；1-1-萘基)-1H-吡咯-2,5-二酮；2,3,5,6-
 四氯-4-(甲基磺醯基)吡啶；2-胺基-4-甲基-N-苯基-5-噻唑甲
 醯胺；2-氯-N-(2,3-二氫-1,1,3-三甲基-1H-茚-4-基)-3-吡啶甲
 醯胺；3,4,5-三氯-2,6-吡啶二乙腈；actinovate；順式-1-(4-

5 氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)環庚醇；1-(2,3-二氫-2,2-二
 甲基-1H-茛-1-基)-1H-咪唑-5-羧酸甲酯；碳酸一鉀；N-(6-
 甲氧基-3-吡啶基)-環丙烷羧醯胺；N-丁基-8-(1,1-二甲基乙
 基)-1-氧雜螺[4.5]癸-3-胺；四硫碳酸鈉；與銅鹽類與調配製
 劑，例如酸性棗紅混合物(Bordeaux mixture)；氫氧化銅；
 茶酸銅；鹼性氯氧化銅；硫酸銅；銅合浦(cufraneb)；氧化
 銅；mancopper；快得寧-銅(oxine-copper)。

殺菌劑類：

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

15

殺蟲劑/殺蟎劑/殺線蟲劑類：

阿巴丁(abamectin)，ABG-9008，歐殺松(aephate)，
 (acequinocyl)，亞滅培(acetamiprid)，亞多普(acetoprole)，
 克力寧(acrinathrin)，AKD-1022，AKD-3059，AKD-3088，
 20 亞蘭克(alanycarb)，得滅克(aldicarb)，亞多西克
 (aldoxycarb)，阿連寧(allethrin)，阿連寧IR-異構物(allethrin
 IR-isomers)，甲型西美寧(alpha-cypermethrin)(亞滅寧
 (alphamethrin))，醯胺基富美特(amidoflumet)，胺基卡布
 (aminocarb)，三亞蟎(amitraz)，亞滅汀(avermectin)，AZ

60541，氮雜雷丁(azadirachtin)，氮雜滅松(azamethiphos)，
 谷速松-甲基(azinphos-methyl)，谷速松-乙基
 (azinphos-ethyl)，亞環錫(azocyclotin)，popilliae桿菌，
 sphaericus桿菌，枯草桿菌，蘇力菌，蘇力菌菌株EG-2348，
 5 蘇力菌菌株GC-91，蘇力菌菌株NCTC-11821，昆蟲桿狀病
 毒(baculoviruses)，Beauveria bassiana，Beauveria tenella(白
 殭菌)，免敵克(bendiocarb)，免扶克(benfuracarb)，免速達
 (bensultap)，西脫(benzoximate)，乙型-賽扶寧
 (betacyfluthrin)，乙型-西普美寧(beta-cypermethrin)，貝路
 10 寧(bifenazate)，畢芬寧(bifenthrin)，百那培克(binapacryl)，
 百阿連寧(bioallethrin)，百阿連寧-S-環戊基-異構物，百索
 美寧(bioethanomethrin)，百普美寧(biopermethrin)，百雷美
 寧(bioresmethrin)，雙三氟隆(bistrifluron)，丁滅蟲(BPMC)，
 伯芬普(brofenprox)，布莫松-乙基(bromophos-ethyl)，溴丙
 15 基樂(bromopropylate)，溴芬文松(bromfenvinfos (-甲基))，
 BTG-504，BTG-505，布芬克(bufencarb)，布芬淨
 (buprofezin)，布他硫松(butathiofos)，布嘉信
 (butocarboxim)，丁氧基嘉信(butoxycarboxim)，丁基比達本
 (butylpyridaben)，卡丟松(cadusafos)，坎芬七拉
 20 (camphechlor)，加保力(carbaryl)，加保扶(carbofuran)，加
 芬松(carbophenothion)，丁基加保扶(carbosulfan)，培丹
 (cartap)，CGA-50439，奇諾美塞奈(chinomethionat)，氯丹
 (chlordane)，氯二美風(chlordimeform)，氯索克
 (chloethocarb)，氯乙氧松(chlorethoxyfos)，氯芬比

(chlorfenapyr) , 氯 芬 文 松 (chlorfenvinphos) , 氯 福 隆
(chlorfluazuron) , 氯 滅 松 (chlormephos) , 氯 苯 吉
(chlorobenzilate) , 氯 比 克 林 (chloropicrin) , 氯 普 芬
(chlorproxyfen) , 陶 斯 松 - 甲 基 (chlorpyrifos-methyl) , 陶 斯 松
5 - 乙 基 , 氯 波 寧 (chlovaporthrin) , 克 馬 芬 諾 再
(chromafenozide) , 順 - 賽 美 寧 (cis-cypermethrin) , 順 - 雷 滅 寧
(cis-resmethrin) , 順 波 滅 寧 (cis-permethrin) , 環 西 寧
(clocythrins) , 克 羅 索 克 (cloethocarb) , 克 芬 淨 (clofentezine) ,
克 塞 尼 啉 (clothianidine) , 克 塞 唑 苯 (clothiazoben) , 扣 得 蒙
10 (codlemone) , 庫 馬 松 (coumaphos) , 氰 芬 松 (cyanofenphos) ,
氰 松 (cyanophos) , 環 普 平 (cycloprene) , 環 普 寧
(cycloprothrin) , (Cydia pomonella) , 賽 扶 寧 (cyfluthrin) , 賽
洛 寧 (cyhalothrin) , 錫 滿 丹 (cyhexatin) , 賽 滅 寧
(cypermethrin) , 西 芬 諾 寧 (cyphenothrin, IR-反 式 - 異 構 物) ,
15 克 馬 精 (cyromazine) , DDT , 第 滅 寧 (deltamethrin) , 滅 賜 松
-S- 甲 基 , 滅 賜 松 -S- 甲 基 , 汰 芬 隆 (diafenthion) , 得 拉 松
(dialifos) , 大 利 松 (diazinon) , 二 氯 芬 松 (dichlofenthion) , 二
氯 松 (dichlorvos) , 二 克 福 (dicofol) , 二 克 多 松 (dicrotophos) ,
二 環 尼 (dicyclanil) , 二 福 隆 (diflubenzuron) , 大 滅 松
20 (dimethoate) , 二 甲 基 文 松 (dimethylvinphos) , 二 諾 布 冬
(dinobuton) , 丁 諾 卡 普 (dinocap) , 二 諾 帖 夫 (dinotefuran) ,
二 歐 芬 諾 蘭 (diofenolan) , 二 硫 松 (disulfoton) , 多 卡 沙 特 - 鈉
(docusat-sodium) , 多 芬 那 比 (dofenapyn) , DOWCO-439 , 伊
伏 矽 那 特 (eflusilanate) , 伊 邁 丁 (emamectin) , 伊 邁 丁 - 苯 甲

酸鹽 (emamectin-benzoate) , 安本寧 (empenthrin)(IR-異構
 物) , 安多沙凡 (endosulfan) , Entomopftora spp. , EPN , 愛
 芬化利 (esfenvalerate) , 愛殺芬克 (ethiofencarb) , 依昔普
 (ethiprole) , 愛殺松 (thion) , 依索普松 (ethoprophos) , 依多
 5 芬普 (etofenprox) , 依多唑 (etoxazole) , 依特滅松
 (etrimphos) , 飛福 (famphur) , 芬滅松 (fenamiphos) , 芬雜寧
 (fenazaquin) , 芬佈賜 (fenbutatin oxide) , 撲滅松
 (fenitrothion) , 芬硫克 (fenothiocarb) , 芬雜肯 (fenoxacrim) ,
 芬殺克 (fenoxycarb) , 芬普寧 (fenpropathrin) , 芬皮拉
 10 (fenpyrad) , 芬比寧 (fenpyrithrin) , 芬普克邁
 (fenpyroximate) , 芬殺松 (fenthion) , 芬化利 (fenvalerate) ,
 懷普尼 (fipronil) , flonicamid , fluacrypyrim , 福查隆
 (fluazuron) , 福本吉明 (flubenzimine) , 福布賽寧特
 (flubrocyclothrinate) , 福環隆 (flucycloxuron) , 護賽寧
 15 (flucythrinate) , 氟芽林 (flufenerim) , 氟芬殺隆
 (flufenoxuron) , 氟芬普 (flufenprox) , 福美寧 (flumethrin) ,
 福比唑松 (flupyrzofos) , 福特淨 (flutenzine) , 福化利
 (fluvalinate) , 大福松 (fonophos) , (formetanate) , 福莫松
 (formothion) , 福美塞連 (fosmethilan) , 福賽熱 (fosthiazate) ,
 20 福芬普 (fubfenprox) , 福硫克 (furathiocarb) , γ -HCH ,
 gossypure , grandlure , 粒形病毒 (granulosis viruses) , 鹵芬
 普 (halofenprox) , 鹵芬諾採 (halofenozide) , HCH , HCN-801 ,
 飛達松 (heptenophos) , 六福隆 (hexaflumuron) , 合賽唑
 (hexythiazox) , 海甲基隆 (hydramethylnone) , 氫普平

(hydroprene), IKA-2002, 益達胺(imidacloprid), 伊米普寧(imiprothrin), 引多查克(indoxacarb), 碘芬松(iodofenphos), 艾普本松(iprobenfos), 愛唑松(isazofos), 亞芬松(isofenphos), 異普克(isoprocarb), 加福松(isoxathion), 沃美丁(ivermectin), 金龜子性誘劑japonilure, 卡得寧(kadethrin), nuclear polyhedrosis 病毒, 基諾普平(kinoprene), λ -賽洛寧, 靈丹(lindane), 路芬隆(lufenuron), 馬拉松(malathion), 滅加松(mecarbam), 滅速芬松(mesulfenfos), 滅達醛(metaldehyde), 美田-鈉(metam-sodium), 滅克里松(methacrifos), 達馬松(methamidophos), (Metharhizium anisopliae), (metharhizium flavoviride), 滅大松(methidathion), 滅賜克(methiocarb), 納乃得(methomyl), 美賜平(methoprene), 美索克(methoxychlor), 甲氧基芬諾得(methoxyfenozide), 治滅蝨(metolcarb), 美索達宗(metoxadiazone), 美文松(mevinphos), 密滅汀(milbemectin), 密本奧素(milbemycin), MKI-245, MON-45700, 亞素靈(monocrotophos), 莫克西得丁(moxidectin), MTI-800, 乃立松(naled), NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, 尼克鹽胺(niclosamide), 菸鹼酸, 奈登比南(nitenpyram), 奈塞井(nithiazine), NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, 諾瓦隆(novaluron), 諾維福隆(noviflumuron), OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, 歐滅松(omethoate), 歐殺滅(oxamyl), 氧滅多松

- 甲基(oxydemeton-methyl), Paecilomyces fumosoroseus, 巴拉松-甲基(parathion-methyl), 巴拉松-乙基, 百滅寧(permethrin)(順式-, 反式-), 凡士林(petroleum), PH-6045, 芬諾寧(phenothrin(1R-反式異構物)), 賽達松(phenthoate), 福瑞松(phorate), 裕必松(phosalone), 益滅松(phosmet), 福賜米松(phosphamidon), 磷克(phosphocarb), 巴賽松(phoxim), 胡椒酮基丁氧化物(piperonyl butoxide), 比畦米克(pirimicarb), 亞特松-甲基(pirimiphos-methyl), 亞特松-乙基, 普拉寧(prallethrin), 佈飛松(profenofos), 普滅克(promecarb), 普巴松(propaphos), 歐蟊多(propargite), 普佩他松(propetamphos), 安丹(propoxur), 普硫松(prothiofos), 普梭特(prothoate), 普地芬布(protifenbute), 比美唑精(pymetrozine), 白克松(pyraclofos), 必滅寧(pyresmethrin), 必剎冷(pyrethrum), 畢達本(pyridaben), 必達基(pyridalyl), 必達芬松(pyridaphenthion), 必達松(pyridathion), 畢汰芬(pyrimidifen), 百利普芬(pyriproxyfen), 拜裕松(quinalphos), 雷美寧(resmethrin), RH-5849, 雷巴威林(ribavirin), RU-12457, RU-15525, S-421, S-1833, 賽力松(salithion), 喜巴松(sebufos), SI-0009, 西拉扶芬(silafluofen), 賜諾殺(spinosad), 螺達克芬(spiroclufen), 螺美西芬(spiromesifen), 速服拉米得(sulfluramid), 薩扶貼(sulfotep), 薩普松(sulprofos), SZI-121, 套-福化利(tau-fluvalinate), 鐵布芬得(tebufenozide), 鐵芬比拉(tebufenpyrad), 鐵畢密松(tebupirimiphos), 得福隆

(teflubenzuron)，得福寧(tefluthrin)，得滅松(temephos)，得米文松(temiviphos)，特辦(terbam)，托福松(terbufos)，樂本文松(tetrachlorvinphos)，四地松(tetradifon)，四美寧(tetramethrin)，四美寧(IR-異構物)，四速(tetrasul)，色-賽普寧(theta-cypermethrin)，塞克比(thiacloprid)，塞美索(thiamethoxam)，塞普尼(thiapronil)，賽三松(thiatriphos)，(thiocyclam 氫草酸鹽)，硫敵克(thiodicarb)，賽芬殺(thiofanox)，硫滅松(thiometon)，thiosultap-sodium，蘇力精(thuringiensin)，特羅西寧(tralocythrin)，泰滅寧(tralomethrin)，transfluthrin，三拉忍(triarathene)，三雜美特(triazamate)，三落松(triazophos)，三阿隆(triazuron)，三氯芬啶(trichlophenidine)，三氯松(trichlorfon)，三福隆(triflumuron)，三滅沙克(trimethacarb)，繁米松(vamidothion)，繁尼利普(vaniliprole)，(verbutin)，Verticillium lecanii，WL-108477，WL-40027，YI-5201，YI-5301，YI-5302，XMC，xylylcarb，ZA-3274，zeta-賽美寧(zeta-cypermethrin)，唑拉普松(zolaprofos)，ZXI-8901，化合物3-甲基苯基丙基胺基甲酸酯(tsumacide Z)，化合物3-(5-氯-3-吡啶基)-8-(2,2,2-三氟乙基)-8-氮雜雙環[3.2.1]-辛烷-3-乙腈(CAS-Reg. No. 185982-80-3)與相關的3-內-異構物(CAS-Reg. No. 185984-60-5)(參考 WO-96/37494，WO-98/25923)，與包含具殺菌活性的植物萃出物、線蟲、真菌或病毒之製劑。

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

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

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

當使用本發明的活性化合物作為殺真菌劑時，施用的比率可在很大的範圍間變動，視施用的種類而定，處理植物的部位時，活性化合物的施用率通常為介於0.1與10,000克/公頃間，宜為介於10與1000克/公頃間；供處理種子時，

活性化合物的施用率通常為對每公斤的種子使用介於0.001克與50克，宜為對每公斤的種子施用介於0.01與10克間的量，處理土壤時，活性化合物的施用率通常為介於0.1與10,000克/公頃間，宜為介於1與5000克/公頃間。

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

 特別適宜地，購得或被使用的植物栽培品種的植物被依本發明處理，所謂的植物栽培品種是指藉由傳統的栽培
15 方式生長得到的具新穎性質(“特色”)之品系，可以是經由傳統的育種，藉突變或藉重組DNA技術栽培而得者，這些可以是栽培品種，同型小種(biotype)或基因型品種。

 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，營養期間，特別養分)，依本發明的處理法也可
20 獲得超加成的(“加乘的”)效果，故，例如減低的施用比率及/或增廣的活性譜及/或增進本發明使用的物質與組成物之活性、較佳的植物生長、對高溫或低溫更具耐力，更耐乾旱或耐潮濕或耐土壤鹽含量、增加開花期、較容易收割、加速的成熟、較高的收穫量、較佳的品質及/或具較高的營

養價值之收穫物、較佳的儲存安定性及/或收穫產品的可加工性，可能超出被預期的效果。

宜以本發明處理之轉殖基因的植物或植物品種(即那些藉由基因工程取得者)包括所有經基因改造、獲得參與有利的有用性質(新特色)之基因材料之植物，這類性質的實例為：較佳的植物生長、更耐高溫或低溫，更耐乾旱或耐潮濕或耐土壤鹽含量、增加的開花期、更容易的收割、加速的成熟、較高的收穫量、較佳的品質及/或收穫品具較高的營養價值、較佳的儲存安定性及/或收穫產品的可加工性，另外且特別要強調的這類性質實例為：植物對抗動物及微生物等有害生物(例如昆蟲，蟎類，植物病源性真菌，細菌及/或病毒類)具更佳的防禦性，也增加植物對某些具除草活性的化合物之耐性，可提及的轉殖基因的植物為重要的作物植物，例如穀物(例如小麥，稻米)，玉米，大豆，馬鈴薯，棉花，煙草，油菜與果樹(蘋果樹，水梨，柑橘與葡萄)，與特別強調的為玉米，大豆，馬鈴薯，棉花，煙草與油菜，被強調的特色為藉由形成於植物中的毒素使增加植物抵抗力以對抗蜘蛛、線蟲與蛞蝓與蝸牛，特別是那些藉由來自於蘇力菌桿菌(例如基因CryIA(a)，CryIA(b)，CryIA(c)，CryIIA，CryIIIA，CryIIIB2，Cry9c，Cry2Ab，Cry3Bb與CryIF以及其併用物)(下面以“Bt植物”稱呼之)形成於植物體中的基因材料；特別被強調的特色為藉由全株性後天抵抗性(SAR)，systemin，植物抗毒素(phytoalexins)，誘出物(elicitors)與抗性基因與相關的表現的蛋白質與毒素而增加

植物對抗真菌、細菌與病毒之抗性；另一被強調的特色為植物對某些除草活性化合物(例如咪唑啉酮類，磺醯基脲類，草甘膦或膦基三辛(phosphinotricin)(例如“PAT”基因))之耐性增加，參與至所要的特色的基因毫無疑問的也可與他種基因成混合型式出現於轉殖基因的植物，可提及的“Bt植物”為以下列貿易名稱(trade name)販售之玉米品種(maize varieties)、棉花品種、大豆品種與馬鈴薯品種：YIELD GARD®(例如玉米，棉花，大豆)，KnockOut®(例如玉米)，StarLink®(例如玉米)，Bollgard®(棉花)，Nucoton®(棉花)與NewLeaf®(馬鈴薯)；可提及的耐殺草劑的植物類為以下列貿易名稱販售之玉米品種、棉花品種與大豆品種：Roundup Ready®(耐嘉磷塞納，例如玉米，棉花，大豆)，Liberty Link®(耐膦基三辛，例如油菜)，IMI®(耐咪唑啉酮)與STS®(耐磺醯基脲，例如玉米)；可提及的抗除草劑之植物(以傳統方式育成的耐除草劑之植物)包括以Clearfield®之名稱販賣者(例如玉米)，當然，這些聲明也適用於具這些基因特色或具有仍在被發展的基因特色之植物栽培品種，其在將來會被發展及/或販售者。

所列出之植物可依本發明的特別有利的方式以本發明的式I化合物或活性化合物混合物處理，上述較佳的活性化合物或混合物的較佳的範圍也適於應用於這些植物的處理，特別是以本文中特別提出的化合物或混合物給予之處理。

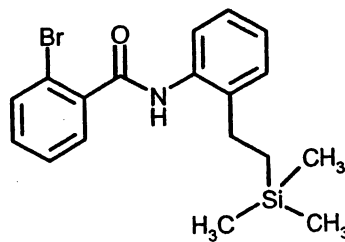
根據本發明的配製劑與活性化合物的用途，再以下述

實例予以說明。

【實施方式】

製備實例

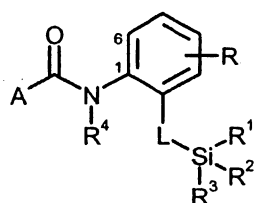
實例 1



425毫克的2-(2-三甲基矽烷基乙基)苯基胺(2.2毫莫耳)與438毫克(2.0毫莫耳)的2-溴-苯甲醯基氯，被溶解於20毫升的乙腈，加入332毫克(2.4毫莫耳)的碳酸鉀，在室溫下將反應混合物攪拌18小時，再加入20毫升的水，混合液經乙酸乙酯萃取，被乾燥(使用硫酸鈉)，除去溶劑後，置於矽膠 60的管柱層析純化(溶離相：二氯甲烷)，製得405毫克(54% 理論值)的2-溴-N-[2-(2-三甲基矽烷基-乙基)苯基]苯甲醯胺 [$\log P$ (pH 2.3) = 4.32]。

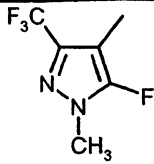
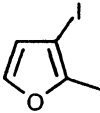
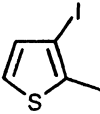
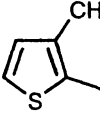
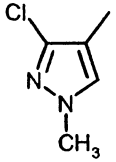
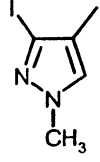
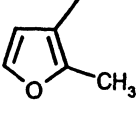
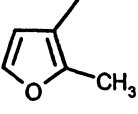
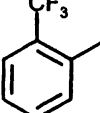
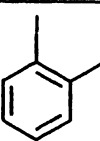
列於下面表1的式(I)化合物也可依照類似於實例1及根據本發明的製法(a)與製法(b)中之一般說明而製得：

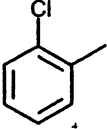
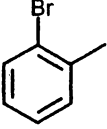
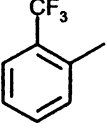
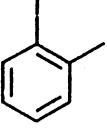
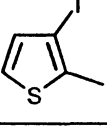
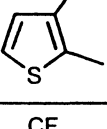
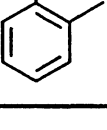
表 1



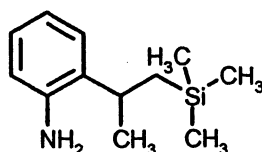
(I)

Ex.	R	L	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	logP
2	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.67
3	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.63
4	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.40
5	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.29
6	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.37
7	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.58
8	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3.68
9	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3.95

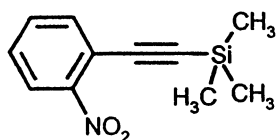
Ex.	R	L	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	logP
10	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.19
11	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.73
12	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		5.05
13	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.43
14	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3.89
15	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3.94
16	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.03
17	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.33
18	H	*-CH≡CH-#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.78
19	H	*-CH≡CH-#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.97

Ex.	R	L	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	logP
20	H	*-CH≡CH-#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.96
21	H	*-CH≡CH-#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.93
22	4-F	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.61
23	4-F	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.64
24	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.85
25	4-F	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.79
26	4-F	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.39

以星號(*)標示的鍵係被附接至苯胺基，以井號(#)標示的鍵係被附接至矽取代基。

式(III)的起始材料之製備實例 (III-1)

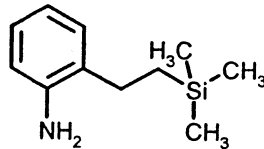
將17.7克的苯胺(0.19莫耳)、50克的烯丙基三甲基矽烷(0.44莫耳)、1.5克的三氯化鋁(0.01莫耳)與0.5克的鋁粉(0.02莫耳)混合在一起並在255°C的加壓釜中攪拌10小時，待冷卻至室溫後，先加入100毫升的甲苯，再加入40毫升，溶解於水中之40%強度的NaOH，並再加入100毫升的水，在35°C下將混合物攪拌15分鐘，冷卻後，混合物經甲苯萃取，萃取物以水洗滌後以碳酸鉀乾燥，減壓蒸發除去溶劑，蒸餾(55°C-60°C，0.08 毫巴)後製得1.4克的 2-(1-甲基-2-三甲基矽烷基乙基)苯基胺 [$\log P$ (pH 2.3) = 3.05]。

實例 (III-2)步驟 1

在氮氣層中，將4克(20毫莫耳)的鄰-溴硝基苯、842毫克(1.2毫莫耳)的二(三苯基-膦)鈹(II)氯與230毫克(1.2毫莫耳)的碘化銅(I)，先共同置入40毫升的三乙基胺內，在室溫下，

再以10分鐘的期間，滴入2.95克(30毫莫耳)的三甲基矽烷基乙炔，在室溫下攪拌2天，反應混合物被倒入至50毫升的水中並以各50毫升的二乙醚萃取三遍，萃取物經硫酸鈉乾燥後濃縮之，置於矽膠60上進行管柱-層析(溶離相：環己烷/乙酸乙酯3:1)，製得4.2克(96% 理論值)的三甲基-(2-硝基苯基-乙炔基)矽烷[logP (pH 2.3) = 4.12]。

步驟 2



將10.9克(50毫莫耳)的三甲基-(2-硝基苯基乙炔基)矽烷溶解至200毫升的甲醇中，加入0.5克的鈀/碳(5%)，然後在4巴的加壓釜中進行氫化反應12小時，除去溶劑後，置於矽膠60上進行管柱-層析(溶離相：二氯甲烷)，製得4.1克的2-(2-三甲基矽烷基乙基)苯基胺[logP (pH 2.3) = 2.58]。

所得的logP 值，係依照EEC Directive 79/831 Annex V.A8的方法，藉HPLC (高效能液相層析)，於反相柱層(C 18)中測定得到的值；溫度：43°C。

測定酸性範圍(pH 2.3)的溶離相為：0.1%磷酸水溶液，乙腈；線型梯度自10%乙腈至90多乙腈。

校準方式係使用具有已知的logP值之不分枝的烷-2-酮類(3至16個碳原子)進行(由滯留時間，使用介於兩相繼的烷酮類之線型內插法，測定得logP值)。

λ -max 值係使用自200奈米至400奈米的UV光譜下測得的
最大發色訊號值。

使用實例

5 實例 A

黑星菌(*Venturia*)試驗(蘋果)/保護性

溶劑： 24.5 份重的丙酮
24.5 份重的二甲基乙醯胺

10 乳化劑： 1.0 份重的烷基芳基聚甘醇醚

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

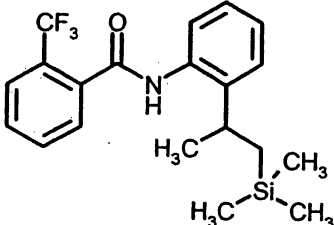
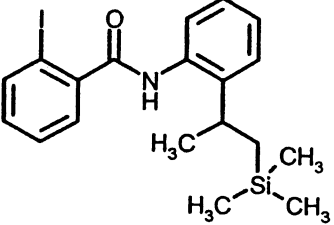
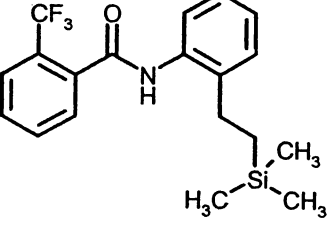
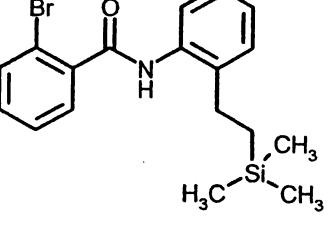
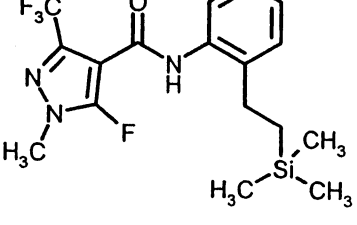
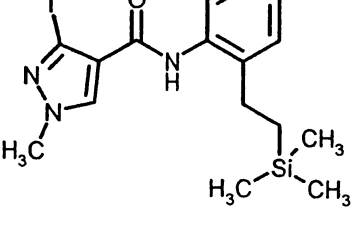
15 為測試保護的活性，以所述的施用率將活性化合物的調配劑噴灑於植物幼苗上，待噴灑塗層乾後，將植物接種上蘋果黑星病原菌(*Venturia inaequalis*)的分生孢子之水懸浮液，然後置於溫度為約20℃、相對濕度為100%之培養室中經一天。

20 其後將植物移至溫度為約21℃，且相對的大氣濕度為約90%之溫室中。

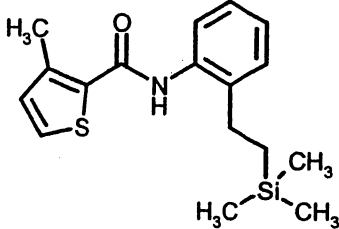
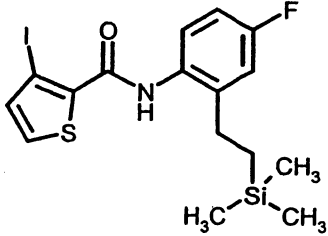
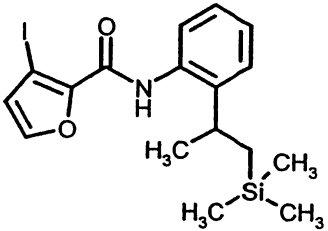
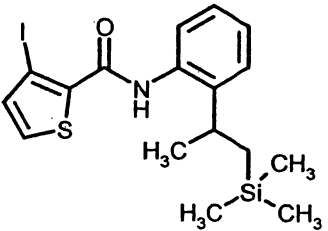
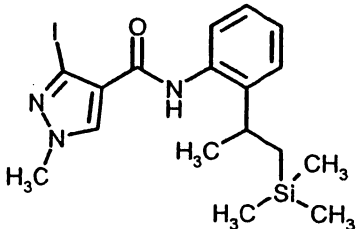
於接種後第10天進行評估，0% 代表無效果，即對照組之情況，而100% 代表沒有發現受感染。

表 A

黑星菌(蘋果)試驗/保護性

本發明之活性化合物	活性化合物的施用 率(克/公頃)	%有效性
	100	99
	100	100
	100	84
	100	87
	100	100
	100	100

黑星菌(蘋果)試驗/保護性

本發明之活性化合物	活性化合物的施用率(克/公頃)	%有效性
	100	100
	100	100
	100	100
	100	100
	100	99

實例 B

單絲殼(*Sphaerotheca*)試驗(黃瓜)/保護性

溶劑：49份重的N,N-二甲基甲醯胺

5 乳化劑：1份重的烷基芳基聚甘醇醚

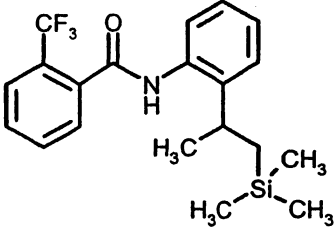
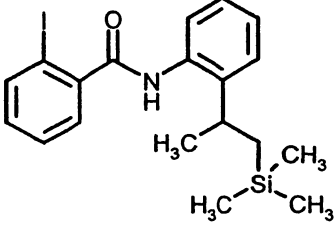
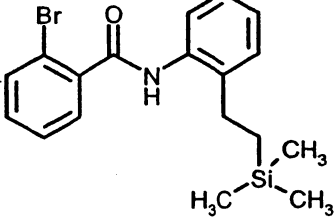
為產生適當的活性化合物之調配劑，將一份重的活性化合物與所述量的溶劑及乳化劑混合，並以水將此濃縮物稀釋至所要濃度。

10 為測試保護的活性，以所述的施用率將活性化合物的調配劑噴灑於幼年黃瓜植物上，經一天的處理後，將植物接種上紅豆白粉病菌(*Sphaerotheca fuliginea*)的孢子懸浮液，然後將植物置於溫度為23℃、相對濕度為70%之溫室中。

15 於接種後第7天進行評估，0% 代表相當於對照組之效力，而100% 代表沒有發現受感染。

表 B

單絲殼試驗(黃瓜) / 保護性

本發明之活性化合物	活性化合物的施用 率(克/公頃)	%有效性
	750	100
	750	100
	750	100

實例 C**銹菌(Puccinia)試驗(小麥) /保護性**

溶劑： 50份重的N,N-二甲基甲醯胺

5 乳化劑： 1份重的烷基芳基聚甘醇醚

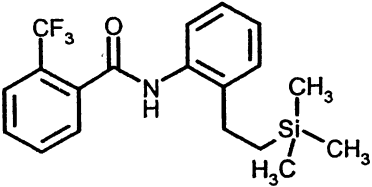
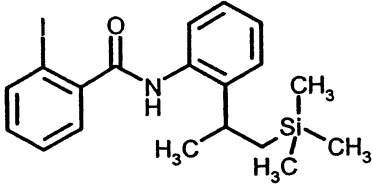
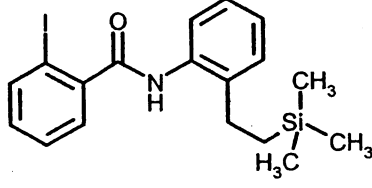
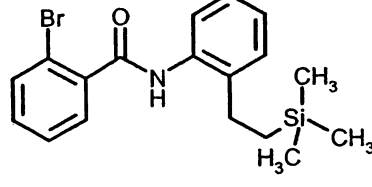
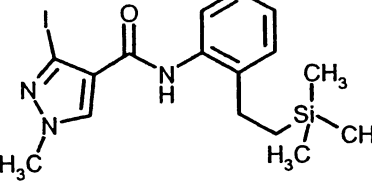
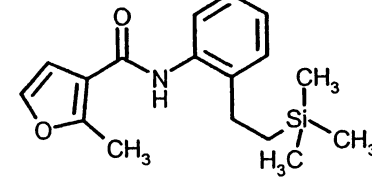
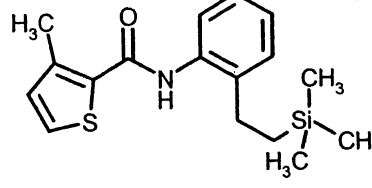
為產生適當的活性化合物之調配劑，將一份重的活性化合物與所述量的溶劑及乳化劑混合，並以水將此濃縮物稀釋至所要濃度。

10 為測試保護的活性，以所述的施用率將活性化合物的調配劑噴灑於植物幼苗上，待噴灑塗層乾後，將植物噴灑上小麥赤銹病菌(Puccinia recondita)的分生孢子之懸浮液，然後置於溫度為約20°C、相對濕度為100%之培養室中經48小時。其後將植物移至溫度為約20°C，且相對的大氣濕度為約80%
15 之溫室中促進赤銹病菌的發展。

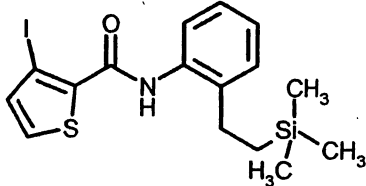
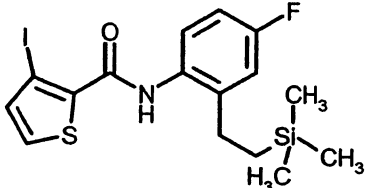
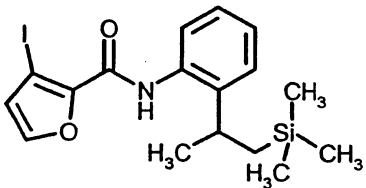
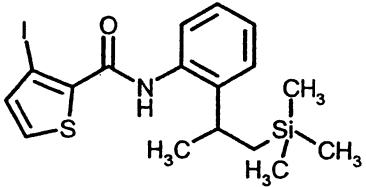
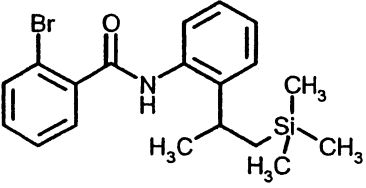
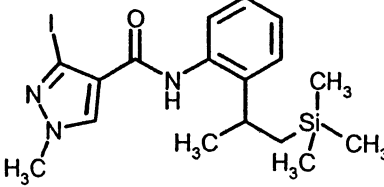
於接種後第10天進行評估，0% 代表相當於對照組之效力，而100% 代表沒有發現受感染。

表 C

銹菌試驗(小麥)/保護性

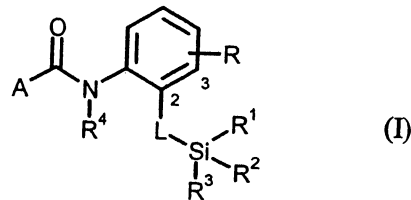
本發明之活性化合物	活性化合物的施用率(克/公頃)	%有效性
	500	93
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

銹菌試驗(小麥)/保護性

本發明之活性化合物	活性化合物的施用率(克/公頃)	%有效性
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

五、中文發明摘要：

具式(I)之新穎矽烷基化之羧醯胺類

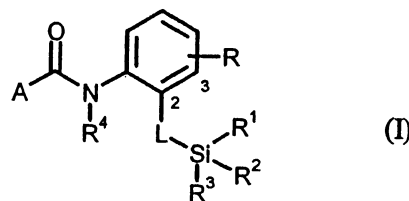


其中 R, L, R¹, R², R³, R⁴與A的定義同於說明書中之定義，

10 這些化合物的多種製備法及以其供防治不想要的微生物之用途，以及新穎的中間物及其製備法。

六、英文發明摘要：

Novel silylated carboxamides of the formula (I)



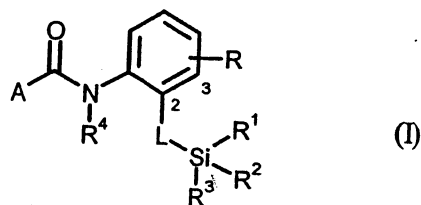
In which

20 R, L, R¹, R², R³, R⁴ and A are as defined in the description,

A plurality of processes for preparing these compounds and their use for controlling unwanted microorganisms.

十、申請專利範圍：

1. 一種具式(I)的矽烷基化之羧醯胺類



其中

R 代表氫，氟，氯，甲基，異丙基，甲硫基或三氟甲基，

L 代表直接鍵或代表各為選擇地經取代的直鏈或分枝的伸烷基(烷二基)，伸烯基(烯二基)或伸炔基(炔二基)，

R^1 與 R^2 分別獨立地各自代表氫， C_1 - C_8 -烷基， C_1 - C_8 -烷氧基， C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基， C_1 - C_4 -烷硫基- C_1 - C_4 -烷基或 C_1 - C_6 -鹵素烷基，

R^3 代表氫， C_1 - C_8 -烷基， C_1 - C_8 -烷氧基， C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基， C_1 - C_4 -烷硫基- C_1 - C_4 -烷基， C_2 - C_8 -烯基， C_2 - C_8 -炔基， C_1 - C_6 -鹵素烷基， C_2 - C_6 -鹵素烯基， C_2 - C_6 -鹵素炔基， C_3 - C_6 -環烷基，或代表分別獨立地各為選擇地經取代的苯基或苯基烷基，

R^4 代表氫， C_1 - C_8 -烷基， C_1 - C_6 -烷基亞磺醯基， C_1 - C_6 -烷基磺醯基， C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基， C_3 - C_8 -環烷基；各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之 C_1 - C_6 -

鹵素烷基，C₁-C₄-鹵素烷硫基，C₁-C₄-鹵素烷基亞
 磺醯基，C₁-C₄-鹵素烷基磺醯基，鹵素-C₁-C₄-烷氧
 基-C₁-C₄-烷基，C₃-C₈-鹵素環烷基；甲醯基，甲醯
 基-C₁-C₃-烷基，(C₁-C₃-烷基)羰基-C₁-C₃-烷基，
 5 (C₁-C₃-烷氧基)羰基-C₁-C₃-烷基；各帶有1至13個
 氟、氯及/或溴原子之鹵素-(C₁-C₃-烷基)羰基
 -C₁-C₃-烷基，鹵素-(C₁-C₃-烷氧基)羰基-C₁-C₃-烷
 基；(C₁-C₈-烷基)羰基，(C₁-C₈-烷氧基)羰基，(C₁-C₄-
 烷氧基-C₁-C₄-烷基)羰基，(C₃-C₈-環烷基)羰基；各
 10 帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之(C₁-C₆-鹵素烷基)
 羰基，(C₁-C₆-鹵素烷氧基)羰基，(鹵素-C₁-C₄-烷氧
 基-C₁-C₄-烷基)羰基，(C₃-C₈-鹵素環烷基)羰基；或
 -C(=O)C(=O)R⁵，-CONR⁶R⁷或-CH₂NR⁸R⁹，

R⁵ 代表氫，C₁-C₈-烷基，C₁-C₈-烷氧基，C₁-C₄-烷氧
 15 基-C₁-C₄-烷基，C₃-C₈-環烷基；各帶有1至9個氟、
 氯及/或溴原子之C₁-C₆-鹵素烷基，C₁-C₆-鹵素烷氧
 基，鹵素-C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基，C₃-C₈-鹵素環
 烷基，

R⁶ 與R⁷ 彼此分別獨立地代表氫，C₁-C₈-烷基，C₁-C₄-
 20 烷氧基-C₁-C₄-烷基，C₃-C₈-環烷基；各帶有1至9
 個氟、氯及/或溴原子之C₁-C₈-鹵素烷基，鹵素
 -C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基，C₃-C₈-鹵素環烷基，

R⁶ 與R⁷ 另外可與其被附接的氮原子一起形成具有5
 至8員環原子之飽和的雜環，其可選擇地經取代一

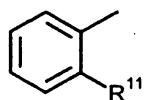
或多個相同或相異的選自包括下列的取代基：鹵素與C₁-C₄-烷基，其中的雜環可再含有1或2個選自包括氧，硫與NR¹⁰之非相鄰的雜原子，

R⁸ 與R⁹ 彼此分別獨立地，代表氫，C₁-C₈-烷基，C₃-C₈-環烷基；各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之C₁-C₈-鹵素烷基，C₃-C₈-鹵素環烷基，

R⁸ 與R⁹另外可與其被附接的氮原子一起形成具有5至8員環原子之飽和的雜環，其可選擇地經取代一或多個相同或相異的選自包括下列的取代基：鹵素與C₁-C₄-烷基，其中的雜環可再含有1或2個選自包括氧，硫與NR¹⁰之非相鄰的雜原子，

R¹⁰ 代表氫或C₁-C₆-烷基，

A 代表式(A 1)之基



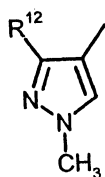
(A1)

其中

R¹¹ 代表氫，鹵素，羥基，氰基，C₁-C₆-烷基，各帶有1至5個鹵素原子之C₁-C₄-鹵素烷基，C₁-C₄-鹵素烷氧基或C₁-C₄-鹵素烷硫基，

或

A 代表式(A2)之基



(A2)

其中

R^{12} 代表氯，碘或二氯甲基，

或

A 代表式(A3)之基



其中

R^{13} 代表 C_1 - C_4 -烷基或帶有 1 至 5 個鹵素原子之
 C_1 - C_4 -鹵素烷基，

10 或

A 代表式(A4)之基



其中

15 R^{13} 代表 C_1 - C_4 -烷基或帶有 1 至 5 個鹵素原子之
 C_1 - C_4 -鹵素烷基，

或

A 代表式(A5)之基



其中

R^{14} 代表 C_1 - C_4 -烷基或帶有 1 至 5 個鹵素原子之
 C_1 - C_4 -鹵素烷基，

或

A 代表式(A6)之基



其中

R^{15} 代表氫，鹵素， C_1 - C_4 -烷基或帶有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵素烷基，

或

A 代表式(A7)之基



其中

R^{16} 代表鹵素，羥基， C_1 - C_4 -烷基， C_1 - C_4 -烷氧基， C_1 - C_4 -烷硫基，各帶有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 -鹵素烷基， C_1 - C_4 -鹵素烷硫基或 C_1 - C_4 -鹵素烷氧基，

或

A 代表式(A8)之基

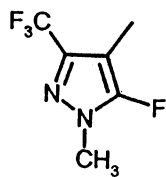


其中

R^{17} 代表 C_1 - C_4 -烷基，

或

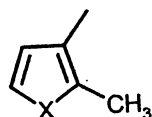
A 代表式(A9)之基



(A9)

或

A 代表式(A10)之基

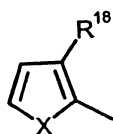


(A10)

X 代表O(氧)或S(硫),

或

A 代表式(A11)之基



(A11)

X 代表O(氧)或S(硫),

R¹⁸ 代表碘或甲基。

2. 根據申請專利範圍第 1 項的式(I)之矽烷基化之羧醯胺類，特徵為，其中

R 代表氫，氟，氯，甲基或三氟甲基，

L 代表直接鍵或代表各為選擇地經鹵素-取代的直鏈或分枝的C₁-C₆-伸烷基，C₂-C₆-伸烯基或C₂-C₆-伸炔基，

R¹ 與R² 分別獨立地各自代表C₁-C₆-烷基，C₁-C₆-烷氧基，C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基或C₁-C₃-烷硫基-C₁-C₃-烷基，

R^3 代表 C_1-C_6 -烷基， C_1-C_6 -烷氧基， C_1-C_3 -烷氧基- C_1-C_3 -烷基， C_1-C_3 -烷硫基- C_1-C_3 -烷基， C_3-C_6 -烯基，苯基或苯甲基，

R^4 代表氫， C_1-C_6 -烷基， C_1-C_4 -烷基亞磺醯基， C_1-C_4 -烷基磺醯基， C_1-C_3 -烷氧基- C_1-C_3 -烷基， C_3-C_6 -環烷基；各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_4 -鹵素烷基， C_1-C_4 -鹵素烷硫基， C_1-C_4 -鹵素烷基亞磺醯基， C_1-C_4 -鹵素烷基磺醯基，鹵素- C_1-C_3 -烷氧基- C_1-C_3 -烷基， C_3-C_8 -鹵素環烷基；甲醯基，甲醯基- C_1-C_3 -烷基， $(C_1-C_3\text{-烷基})$ 羰基- C_1-C_3 -烷基， $(C_1-C_3\text{-烷氧基})$ 羰基- C_1-C_3 -烷基；各帶有1至13個氟、氯及/或溴原子之鹵素- $(C_1-C_3\text{-烷基})$ 羰基- C_1-C_3 -烷基，鹵素- $(C_1-C_3\text{-烷氧基})$ 羰基- C_1-C_3 -烷基； $(C_1-C_6\text{-烷基})$ 羰基， $(C_1-C_4\text{-烷氧基})$ 羰基， $(C_1-C_3\text{-烷氧基-}C_1-C_3\text{-烷基})$ 羰基， $(C_3-C_6\text{-環烷基})$ 羰基；各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之 $(C_1-C_4\text{-鹵素烷基})$ 羰基， $(C_1-C_4\text{-鹵素烷氧基})$ 羰基， $(\text{鹵素-}C_1-C_3\text{-烷氧基-}C_1-C_3\text{-烷基})$ 羰基， $(C_3-C_6\text{-鹵素環烷基})$ 羰基；或 $-C(=O)C(=O)R^5$ ， $-\text{CONR}^6R^7$ 或 $-\text{CH}_2\text{NR}^8R^9$ ，

R^5 代表氫， C_1-C_6 -烷基， C_1-C_4 -烷氧基， C_1-C_3 -烷氧基- C_1-C_3 -烷基， C_3-C_6 -環烷基；各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_4 -鹵素烷基， C_1-C_4 -鹵素烷氧基，鹵素- C_1-C_3 -烷氧基- C_1-C_3 -烷基， C_3-C_6 -鹵素環烷基，

R^6 與 R^7 彼此分別獨立地代表氫， C_1 - C_6 -烷基， C_1 - C_3 -
 烷氧基- C_1 - C_3 -烷基， C_3 - C_6 -環烷基；各帶有1至9
 個氟、氯及/或溴原子之 C_1 - C_4 -鹵素烷基，鹵素
 - C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基， C_3 - C_6 -鹵素環烷基，

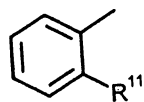
R^6 與 R^7 另外可與其被附接的氮原子一起形成具有5
 或6員環原子之飽和的雜環，其可選擇地經取代一
 至四個相同或相異的選自包括下列的取代基：鹵
 素與 C_1 - C_4 -烷基，其中的雜環可再含有1或2個選自
 包括氧，硫與 NR^{10} 之非相鄰的雜原子，

R^8 與 R^9 彼此分別獨立地，代表氫， C_1 - C_6 -烷基， C_3 - C_6 -
 環烷基；各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之 C_1 - C_4 -
 鹵素烷基， C_3 - C_6 -鹵素環烷基，

R^8 與 R^9 另外可與其被附接的氮原子一起形成具有5或
 6員環原子之飽和的雜環，其可選擇地經取代一或
 多個相同或相異的選自包括下列的取代基：鹵素
 與 C_1 - C_4 -烷基，其中的雜環可再含有1或2個選自包
 括氧，硫與 NR^{10} 之非相鄰的雜原子，

R^{10} 代表氫或 C_1 - C_4 -烷基，

A 代表式(A 1)之基



(A1)

其中

R^{11} 代表氫，氟，氯，溴，碘，羥基，氰基， C_1 - C_4 -
烷基，各帶有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_2 -鹵素烷
基， C_1 - C_2 -鹵素烷氧基或 C_1 - C_2 -鹵素烷硫基，

或

A 代表式(A2)之基



其中

R^{12} 代表氯，碘或二氯甲基，

或

A 代表式(A3)之基



其中

R^{13} 代表甲基，乙基或帶有1至5個氟、氯及/或溴
原子之 C_1 - C_2 -鹵素烷基，

或

A 代表式(A4)之基



其中

R^{13} 代表甲基，乙基或帶有1至5個氟、氯及/或溴
原子之 C_1 - C_2 -鹵素烷基，

或

A 代表式(A5)之基



其中

R^{14} 代表甲基，乙基或帶有1至5個氟、氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 -鹵素烷基，

或

A 代表式(A6)之基



其中

R^{15} 代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基或帶有1至5個氟、氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 -鹵素烷基，

或

A 代表式(A7)之基



其中

R^{16} 代表氟，氯，溴，碘，羥基， C_1 - C_4 -烷基，甲氧基，乙氧基，甲硫基，乙硫基，二氟甲硫基，三氟甲硫基，各帶有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 -鹵素烷基或 C_1 - C_2 -鹵素烷氧基，

或

A 代表式(A8)之基

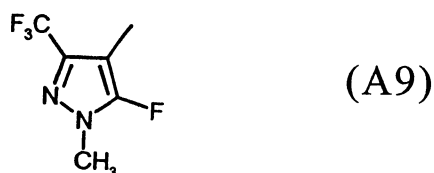


其中

R¹⁷ 代表甲基，乙基，正丙基或異丙基，

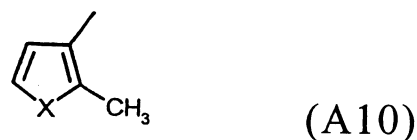
或

A 代表式(A9)之基



或

A 代表式(A10)之基



X 代表 O(氧)或 S(硫)，

或

A 代表式(A11)之基



X 代表 O(氧)或 S(硫)，

R¹⁸ 代表碘或甲基。

3. 一種製備根據申請專利範圍第 1 項的式(I)之矽烷基化之羧醯胺類的方法，特徵為

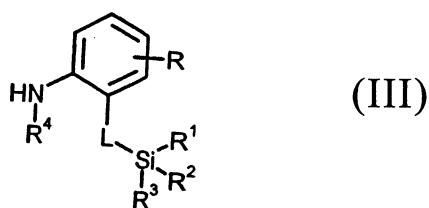
a) 令式(II)之羧酸衍生物類



其中

X^1 代表鹵素或羥基且

A 的定義同於申請專利範圍第1項中的定義，
與式(III)的胺類反應

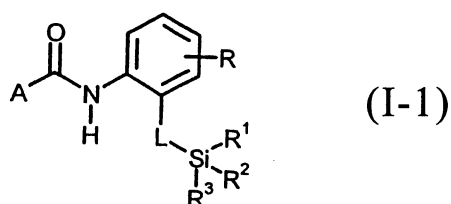


其中R，L， R^1 ， R^2 ， R^3 與 R^4 的定義同於申請專範圍第1項中者，

係在適當的催化劑、適當的縮合劑、適當的酸結合劑及適當的溶劑存在下進行，

或

b) 令式(I-1)之經矽烷基化的羧醯胺類



其中R，L， R^1 ， R^2 ， R^3 與 R^4 的定義同於申請專範圍

圍第1項中者前，

被與式(VIII)的鹵化物反應



其中

X^2 代表氯，溴或碘，

R^{4a} 代表 C_1-C_8 -烷基， C_1-C_6 -烷基亞磺醯基， C_1-C_6 -
 烷基磺醯基， C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基， C_3-C_8 -
 環烷基；各帶有1至9個氟、氯及/或溴原子之
 C_1-C_6 -鹵素烷基， C_1-C_4 -鹵素烷硫基， C_1-C_4 -
 鹵素烷基亞磺醯基， C_1-C_4 -鹵素烷基磺醯基，
 鹵素- C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基， C_3-C_8 -鹵素環
 烷基；甲醯基，甲醯基- C_1-C_3 -烷基，(C_1-C_3 -
 烷基)羰基- C_1-C_3 -烷基，(C_1-C_3 -烷氧基)羰基
 - C_1-C_3 -烷基；各帶有1至13個氟、氯及/或溴原
 子之鹵素-(C_1-C_3 -烷基)羰基- C_1-C_3 -烷基，鹵素
 -(C_1-C_3 -烷氧基)羰基- C_1-C_3 -烷基；(C_1-C_8 -烷基)
 羰基，(C_1-C_8 -烷氧基)羰基，(C_1-C_4 -烷氧基
 - C_1-C_4 -烷基)羰基，(C_3-C_8 -環烷基)羰基；各帶
 有1至9個氟、氯及/或溴原子之(C_1-C_6 -鹵素烷
 基)羰基，(C_1-C_6 -鹵素烷氧基)羰基，(鹵素
 - C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基)羰基，(C_3-C_8 -鹵素
 環烷基)羰基；或 $-C(=O)C(=O)R^5$ ， $-CONR^6R^7$

或 $-\text{CH}_2\text{NR}^8\text{R}^9$ ，其中 R^5 ， R^6 ， R^7 ， R^8 與 R^9 同於
被定義於申請專利範圍第1項的主張中，

係在鹼與稀釋劑存在下進行。

4. 一種供防治不想要的微生物之組成物，特徵為其係包含至少一種根據申請專利範圍第 1 項的式(I)的矽烷基化之羧醯胺，以及展延劑及/或界面活性劑。
5. 一種使用根據申請專利範圍第 1 項的式(I)的矽烷基化之羧醯胺類供防治不想要的微生物之用途。
6. 一種供防治不想要的微生物之方法，特徵為將根據申請專利範圍第 1 項的式(I)的矽烷基化之羧醯胺施加至微生物及/或其生活環境。
7. 一種製備供防治不想要的微生物之組成物的方法，特徵為，將根據申請專利範圍第 1 項的式(I)的矽烷基化之羧醯胺類混合展延劑及/或界面活性劑。

七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第 () 圖。 無

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

無

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

無