



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公告本

(11)證書號數：TW I870523 B

(45)公告日：中華民國 114 (2025) 年 01 月 21 日

(21)申請案號：109144667

(22)申請日：中華民國 109 (2020) 年 12 月 17 日

(51)Int. Cl.：

*A01N43/76 (2006.01)**A01N43/78 (2006.01)**C07D413/04 (2006.01)**C07D417/04 (2006.01)**A01P3/00 (2006.01)*

(30)優先權：2019/12/20

歐洲專利局

19218685.6

(71)申請人：德商拜耳廠股份有限公司 (德國) BAYER AKTIENGESELLSCHAFT (DE)

德國

(72)發明人：杜菲 傑瑞米 DUFOUR, JEREMY (FR)；克諾布洛赫 湯瑪士 KNOBLOCH,

THOMAS (FR)；布魯內特 史蒂芬 BRUNET, STEPHANE (FR)；藍普雷希特 西

比勒 LAMPRECHT, SYBILLE (DE)

(74)代理人：何愛文；王仁君

(56)參考文獻：

TW I823961B

WO 2004/0062361A2

審查人員：謝敏哲

申請專利範圍項數：10 項 圖式數：0 共 116 頁

(54)名稱

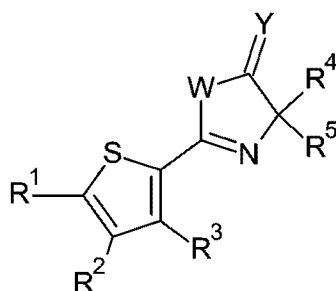
噻吩基噁唑啉酮及類似物

(57)摘要

本發明係有關經取代之噻吩羧醯胺衍生物，其用於防治植物致病性微生物之用途，以及包含其之組成物。

The present disclosure relates to substituted thiophene carboxamides derivatives, their use for controlling phytopathogenic microorganisms and compositions comprising thereof.

特徵化學式：



(I)



公告本

I870523

【發明摘要】

【中文發明名稱】 噻吩基嘮唑啞酮及類似物

【英文發明名稱】 THIENYLOXAZOLONES AND ANALOGUES

【中文】

本發明係有關經取代之噻吩羧醯胺衍生物，其用於防治植物致病性微生物之用途，以及包含其之組成物。

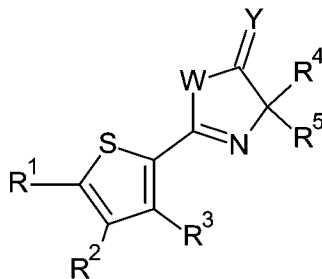
【英文】

The present disclosure relates to substituted thiophene carboxamides derivatives, their use for controlling phytopathogenic microorganisms and compositions comprising thereof.

【指定代表圖】 無

【代表圖之符號簡單說明】 無

【特徵化學式】



(I)

【發明說明書】

【中文發明名稱】 噻吩基噁唑啞酮及類似物

【英文發明名稱】 THIENYLOXAZOLONES AND ANALOGUES

【技術領域】

【0001】 本發明係有關經取代之噻吩羧醯胺衍生物，其用於防治植物致病性微生物之用途，以及包含其之組成物。

【先前技術】

【0002】 儘管迄今為止已開發出許多殺微生物劑，但仍需要開發新的殺微生物化合物，以解決對現代農作物保護劑與組成物之施加而不斷增長的環境與經濟需求。這包括例如，作用範圍之改進、安全型態、選擇性、施加率、殘留物之形成、及良好的製備能力。亦需要有新的化合物，以防止抗藥性出現。

【0003】 本發明提供新穎之化合物，其在至少一些彼等態樣中有相較於已知化合物與組成物之優點。

【0004】 未公開之申請案PCT/EP2019/067824揭示了噻吩羧醯胺衍生物，其可用於保護植物免於植物破壞性微生物的攻擊。WO2004/062361揭示了可有效防治真菌性病害的化合物。其藉由直接作用在不需要之微生物上而發揮作用，且得益於在植物上誘導抗藥性作用。WO2004/062361亦建議，彼等化合物可用於防治細菌性病害，但未提供任何此類活性的證據。發明人發現，彼等化合物在低劑量時，對十字花科黑腐病菌（*Xanthomonas campestris* pv. *Campestris*）的效果差。

【發明內容】

【0005】 本發明係有關如本文所述之式(I)化合物及其異構物、同質多形

體、鹽類、N-氧化物、及溶劑合物。

【0006】本發明係有關一包含如本文所定義之至少一種式(I)化合物與至少一種農藥上適用之載劑的組成物。

【0007】本發明係有關用於製備如本文所述之式(I)化合物及其中間物之方法。

【0008】本發明係有關一用於防治植物致病性微生物之方法，其包含將如本文所定義之至少一種式(I)化合物或如本文所定義之組成物施加至植物、植物部位、種子、果實、或植物生長之土壤的步驟。

【圖式簡單說明】

無。

【實施方式】

定義

【0009】在烷基或烷基磺醯基、烷基亞磺醯基、烷基硫基、烷基胺基之上下文中所使用的「烷基」，舉例而言，可理解為較佳地意指支鏈與非支鏈之烷基，意指如甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、三級丁基、二級丁基、戊基、異戊基、己基、庚基、辛基、壬基、及癸基，及其異構物。

【0010】本文中使用的「烯基」乙詞可理解為較佳地意指支鏈與非支鏈之烯基，如乙烯基、丙烯-1-基、丙烯-2-基、丁-1-烯-1-基、丁-1-烯-2-基、丁-2-烯-1-基、丁-2-烯-2-基、丁-1-烯-3-基、2-甲基-丙-2-烯-1-基、或2-甲基-丙-1-烯-1-基。

【0011】本文中使用的「炔基」乙詞可理解為較佳地意指支鏈與非支鏈之炔基，如乙炔基、丙-1-炔-1-基、丁-1-炔-1-基、丁-2-炔-1-基、或丁-3-炔-1-基。

【0012】本文中使用的「鹵素」或「鹵」等詞可理解為意指氟、氯、溴、

或碘。

【0013】「鹵基」或「鹵」等詞(如「鹵烷基」、「 C_1-C_6 -鹵烷基」、或「 C_1-C_8 -鹵烷基」)表示任意存在一或多個相同或不同的鹵素取代基。

【0014】本文中使用的「鹵烷基」乙詞可理解為較佳地意指如上面定義之支鏈與非支鏈之烷基，其中一或多個氫取代基係以相同或不同的鹵素替代。特別較佳地，該鹵烷基為諸如氯甲基、氟丙基、氟甲基、二氟甲基、三氯甲基、2,2,2-三氟乙基、五氟乙基、溴丁基、三氟甲基、碘乙基、及其異構物。

【0015】本文中使用的「鹵烯基」乙詞可理解為較佳地意指如上面定義之支鏈與非支鏈之烯基，其中一或多個氫取代基係以相同或不同的鹵素替代。

【0016】本文中使用的「鹵炔基」乙詞可理解為較佳地意指如上面定義之支鏈與非支鏈之炔基，其中一或多個氫取代基係以相同或不同的鹵素替代。

【0017】本文中使用的「烷氧基」乙詞意指式(烷基)-O-之基團，其中「烷基」乙詞係如本文所定義。 C_1-C_8 -烷氧基之實例包括但不侷限於，甲氧基、乙氧基、正丙氧基、1-甲基乙氧基、正丁氧基、1-甲基丙氧基、2-甲基丙氧基、1,1-二甲基乙氧基、正戊氧基、1-甲基丁氧基、2-甲基丁氧基、3-甲基丁氧基、2,2-二甲基丙氧基、1-乙基丙氧基、1,1-二甲基丙氧基、1,2-二甲基丙氧基、正己基氧基、1-甲基戊氧基、2-甲基戊氧基、3-甲基戊氧基、4-甲基戊氧基、1,1-二甲基丁氧基、1,2-二甲基丁氧基、1,3-二甲基丁氧基、2,2-二甲基丁氧基、2,3-二甲基丁氧基、3,3-二甲基丁氧基、1-乙基丁氧基、2-乙基丁氧基、1,1,2-三甲基丙氧基、1,2,2-三甲基丙氧基、1-乙基-1-甲基丙氧基、及1-乙基-2-甲基丙氧基。

【0018】本文中使用的「鹵素烷氧基」乙詞意指如上面定義之烷氧基，其中一或多個氫原子係以一或多個可相同或不同的鹵素原子替代。 C_1-C_8 -鹵烷氧基之實例包括但不侷限於，氯甲氧基、溴甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、1-氯乙氧基、1-溴乙氧基、1-氟乙氧基、2-氟乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-

三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、五氟乙氧基、及1,1,1-三氟丙-2-氧基。

【0019】本文中使用的「烷基氫硫基」乙詞意指飽和、直鏈、或支鏈基團之式(烷基)-S-，其中「烷基」乙詞係如本文所定義。C₁-C₈-烷基氫硫基之實例包括但不侷限於，甲基氫硫基、乙基氫硫基、丙基氫硫基、異丙基氫硫基、丁基氫硫基、二級丁基氫硫基、異丁基氫硫基、三級丁基氫硫基、戊基氫硫基、異戊基氫硫基、己基氫硫基。

【0020】本文中使用的「鹵烷基氫硫基」乙詞意指如前面所定義之烷基氫硫基，其中一或多個氫原子係以一或多個可相同或不同的鹵素原子替代。

【0021】本文中使用的「烷基亞磺醯基」乙詞意指飽和、直鏈、或支鏈基團之式(烷基)-S(=O)-，其中「烷基」乙詞係如本文所定義。C₁-C₈-烷基亞磺醯基之實例包括但不侷限於，飽和、直鏈、或支鏈烷基亞磺醯基基，其具有1至8個，較佳地1至6個，且更佳地1至4個碳原子，例如(但不侷限於)，甲基亞磺醯基、乙基亞磺醯基、丙基亞磺醯基、1-甲基乙基亞磺醯基、丁基亞磺醯基、1-甲基丙基亞磺醯基、2-甲基丙基亞磺醯基、1,1-二甲基乙基亞磺醯基、戊基亞磺醯基、1-甲基丁基亞磺醯基、2-甲基丁基亞磺醯基、3-甲基丁基亞磺醯基、2,2-二甲基丙基亞磺醯基、1-乙基丙基亞磺醯基、1,1-二甲基丙基亞磺醯基、1,2-二甲基丙基亞磺醯基、己基亞磺醯基、1-甲基戊基亞磺醯基、2-甲基戊基亞磺醯基、3-甲基戊基亞磺醯基、4-甲基戊基亞磺醯基、1,1-二甲基丁基亞磺醯基、1,2-二甲基丁基亞磺醯基、1,3-二甲基丁基亞磺醯基、2,2-二甲基丁基亞磺醯基、2,3-二甲基丁基亞磺醯基、3,3-二甲基丁基亞磺醯基、1-乙基丁基亞磺醯基、2-乙基丁基亞磺醯基、1,1,2-三甲基丙基亞磺醯基、1,2,2-三甲基丙基亞磺醯基、1-乙基-1-甲基丙基亞磺醯基、及1-乙基-2-甲基丙基亞磺醯基。

【0022】本文中使用的「鹵烷基亞磺醯基」乙詞意指如前面所定義之烷基亞磺醯基，其中一或多個氫原子係以一或多個可相同或不同的鹵素原子替代。

【0023】本文中使用的「烷基磺醯基」乙詞意指飽和、直鏈、或支鏈基團之式(烷基)-S(=O)₂-，其中「烷基」乙詞係如本文所定義。C₁-C₈-烷基磺醯基之實例包括但不侷限於，甲基磺醯基、乙基磺醯基、丙基磺醯基、1-甲基乙基磺醯基、丁基磺醯基、1-甲基丙基磺醯基、2-甲基丙基磺醯基、1,1-二甲基乙基磺醯基、戊基磺醯基、1-甲基丁基磺醯基、2-甲基丁基磺醯基、3-甲基丁基磺醯基、2,2-二甲基丙基磺醯基、1-乙基丙基磺醯基、1,1-二甲基丙基磺醯基、1,2-二甲基丙基磺醯基、己基磺醯基、1-甲基戊基磺醯基、2-甲基戊基磺醯基、3-甲基戊基磺醯基、4-甲基戊基磺醯基、1,1-二甲基丁基磺醯基、1,2-二甲基丁基磺醯基、1,3-二甲基丁基磺醯基、2,2-二甲基丁基磺醯基、2,3-二甲基丁基磺醯基、3,3-二甲基丁基磺醯基、1-乙基丁基磺醯基、2-乙基丁基磺醯基、1,1,2-三甲基丙基磺醯基、1,2,2-三甲基丙基磺醯基、1-乙基-1-甲基丙基磺醯基、及1-乙基-2-甲基丙基磺醯基。

【0024】本文中使用的「鹵烷基磺醯基」乙詞意指如前面所定義之C₁-C₈-烷基磺醯基，其中一或多個氫原子係以一或多個可相同或不同的鹵素原子替代。

【0025】本文中使用的「烷基羰基」乙詞意指飽和、直鏈、或支鏈基團之式(烷基)-C(=O)-，其中「烷基」乙詞如本文所定義。

【0026】本文中使用的「鹵烷基羰基」乙詞意指如前面所定義之烷基羰基，其中一或多個氫原子係以一或多個可相同或不同的鹵素原子替代。

【0027】本文中使用的「烷氧基羰基」乙詞意指飽和、直鏈、或支鏈基團之式(烷氧基)-C(=O)-，其中「烷氧基」係如本文所定義。

【0028】本文中使用的「鹵烷氧基羰基」乙詞意指如前面所定義之烷氧基羰基，其中一或多個氫原子係以一或多個可相同或不同的鹵素原子替代。

【0029】本文中使用的「環烷基」乙詞意指含有環之非芳族單環碳，其具有3至8個碳原子。飽和環烷基之實例包括但不侷限於，環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基、環辛基、環壬基、及環癸基。

【0030】本文中使用的「雜環基」乙詞意指四、五、或六員，飽和或部分不飽和雜環，其含有一至四個獨立地選自於氧、氮、及硫之基團的雜原子。若環含有一個以上的氧原子，則其不直接相鄰。

【0031】本文中使用的「芳基」乙詞意指芳族、碳氫化合物、環系統，其包含6至15個碳原子，或6至12個碳原子，較佳地6至10個碳原子。環系統可為單環或稠合多環(如雙環或三環)芳族環系統。芳基之實例包括但不侷限於，苯基、萘基、蒽基、蔡基、及蒾基。進一步可理解的是，當該芳基經一或多個取代基取代時，該取代基可在該芳基環之任一位置上。特別的是，在芳基為苯基之情況下，該取代基可佔有一或兩個鄰位，一或兩個間位，或對位，或彼等位置之任何組合。此定義亦應用於作為複合取代基(如芳基氧基)之一部分的芳基。

【0032】本文中使用的「芳烷基」乙詞意指經如本文所定義之芳基取代之 C_1-C_6 -烷基。芳烷基之實例包括苄基($-CH_2-C_6H_5$)。

【0033】本文中使用的「芳族5至14員雜環」或「雜芳基」等詞意指芳族環系統，其包含1至4個獨立地選自於由氧、氮、及硫所組成群組之雜原子。芳族雜環包括芳族5或6員單環雜環與6至14員多環(如雙環或三環)芳族雜環。5至14員芳族雜環可藉由任何含於雜環內之碳原子或氮原子連接至母分子部分。

【0034】本文中使用的「 C_1-C_6 」乙詞，諸如在「 C_1-C_6 -烷基」或「 C_1-C_6 -烷氧基」之定義之上下文中，可理解為意指一具有1至6個有限之碳原子數的基團，亦即1、2、3、4、5、或6個碳原子。

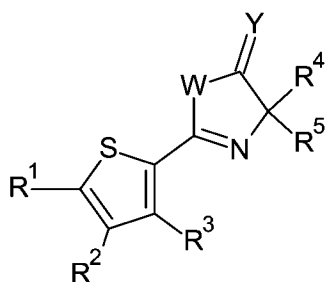
【0035】本文中使用的「 C_1-C_8 」乙詞，諸如在「 C_1-C_8 -烷基」或「 C_1-C_8 -烷氧基」之定義之上下文中，可理解為意指一具有1至8個有限之碳原子數的基團，亦即1、2、3、4、5、6、7、或8個碳原子。

【0036】本文中使用的「側氧基」乙詞意指氧原子經由雙鍵與碳原子或硫原子結合。

【0037】本文中使用的「離去基」乙詞可理解為在取代反應或消去反應中由一化合物替代的基團，如鹵素原子、三氟甲烷磺酸酯(「三氟甲磺酸酯」)基團、烷氧基、甲烷磺酸酯、對甲苯磺酸酯等。

詳細說明

【0038】本發明係有關式(I)化合物：



(I)

其中

R¹、R²係彼此獨立地選自於由鹵素、氰基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵烷基組成之群組；

R³係選自於由氫、鹵素、氰基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵烷基組成之群組；

W、Y係彼此獨立地選自於由氧、硫組成之群組；

R⁴與R⁵係彼此獨立地選自於由氫、C₁-C₆-烷基、芳基-C₁-C₆-烷基或C₃-C₆-碳環組成之群組，其中非環R⁴、R⁵基可經一或多個R^a取代基取代且其中環R⁴、R⁵基可經一或多個R^b取代基取代；或者R⁴與R⁵與其連接之碳原子一起形成C₃-C₆-碳環或3至6員雜環，其中該C₃-C₆-碳環與3至6員雜環可經一或多個R^b取代基取代，R^a係獨立地選自於由硝基、羥基、氰基、羧基、胺基、氫硫基、五氟-λ⁶-氫硫基、甲醯基、胺甲醯基、胺甲酸酯、C₃-C₇-環烷基、具有1至5個鹵素原子之C₃-C₇-鹵環烷基、C₁-C₈-烷基胺基、二-C₁-C₈-烷基胺基、C₁-C₈-烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷氧基、C₁-C₈-烷基氫硫基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基氫硫基、C₁-C₈-烷基羰基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基、C₁-C₈-烷基胺甲醯基、二-C₁-C₈-烷基胺甲醯基、C₁-C₈-烷氧基羰基、具有1至5個

鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基、C₁-C₈-烷基羰基氧基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基氧基、C₁-C₈-烷基羰基胺基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基胺基、C₁-C₈-烷基亞磺醯基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基亞磺醯基、C₁-C₈-烷基磺醯基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基磺醯基；C₁-C₈-烷基磺醯基胺基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基磺醯基胺基；胺磺醯基；C₁-C₈-烷基胺磺醯基與二-C₁-C₈-烷基胺磺醯基組成之群組，R^b係獨立地選自於由鹵素原子、硝基、羥基、氰基、羧基、胺基、氫硫基、五氟-λ⁶-氫硫基、甲醯基、胺甲醯基、胺甲酸酯、C₁-C₈-烷基、C₃-C₇-環烷基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基、具有1至5個鹵素原子之C₃-C₇-鹵環烷基、C₂-C₈-烯基、C₂-C₈-炔基、C₁-C₈-烷基胺基、二-C₁-C₈-烷基胺基、C₁-C₈-烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷氧基、C₁-C₈-烷基氫硫基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基氫硫基、C₁-C₈-烷基羰基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基、C₁-C₈-烷基胺甲醯基、二-C₁-C₈-烷基胺甲醯基、C₁-C₈-烷氧基羰基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷氧基羰基、C₁-C₈-烷基羰基氧基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基氧基、C₁-C₈-烷基羰基胺基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基胺基、C₁-C₈-烷基氫硫基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基氫硫基、C₁-C₈-烷基亞磺醯基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基亞磺醯基、C₁-C₈-烷基磺醯基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基磺醯基、C₁-C₈-烷基磺醯基胺基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基磺醯基胺基、胺磺醯基、C₁-C₈-烷基胺磺醯基、及二-C₁-C₈-烷基胺磺醯基組成之群組；

前提是，若R¹為鹵素且R²為鹵素，則R³係選自於由鹵素、氰基、C₁-C₆-烷基、或C₁-C₆-鹵烷基組成之群組。

前提是，若R¹與R²相同且為溴或氯，則R³為氰基或C₁-C₆-鹵烷基或W為硫或R⁴與R⁵不與其連接之碳原子一起形成環丙基。

【0039】 較佳為，若R¹係選自於由鹵素、氰基組成之群組。

【0040】 依據另一較佳具體實施例， R^2 為鹵素。

【0041】 又較佳為，若 R^3 係選自於由鹵素、氰基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -鹵烷基組成之群組。

【0042】 又較佳為，若

R^1 、 R^2 係彼此獨立地選自於由鹵素、氰基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -鹵烷基組成之群組；

R^3 係選自於由鹵素、氰基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -鹵烷基組成之群組；

W、Y係彼此獨立地選自於由氧、硫組成之群組；

R^4 與 R^5 係彼此獨立地選自於由氫、 C_1 - C_6 -烷基、芳基- C_1 - C_6 -烷基、或 C_3 - C_6 -碳環組成之群組，其中非環 R^4 、 R^5 基可經一或多個 R^a 取代基取代且其中環 R^4 、 R^5 基可經一或多個 R^b 取代基取代；或者 R^4 與 R^5 與其連接之碳原子一起形成 C_3 - C_6 -碳環或3至6員雜環，其中該 C_3 - C_6 -碳環與3至6員雜環可經一或多個 R^b 取代基取代， R^a 係獨立地選自於由硝基、羥基、氰基、羧基、胺基、氫硫基、五氟- λ^6 -氫硫基、甲醯基、胺甲醯基、胺甲酸酯、 C_3 - C_7 -環烷基、具有1至5個鹵素原子之 C_3 - C_7 -鹵環烷基、 C_1 - C_8 -烷基胺基、二- C_1 - C_8 -烷基胺基、 C_1 - C_8 -烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷氧基、 C_1 - C_8 -烷基氫硫基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷基氫硫基、 C_1 - C_8 -烷基羰基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷基羰基、 C_1 - C_8 -烷基胺甲醯基、二- C_1 - C_8 -烷基胺甲醯基、 C_1 - C_8 -烷氧基羰基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷氧基羰基、 C_1 - C_8 -烷基羰基氧基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷基羰基氧基、 C_1 - C_8 -烷基羰基胺基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷基羰基胺基、 C_1 - C_8 -烷基亞磺醯基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷基亞磺醯基、 C_1 - C_8 -烷基磺醯基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷基磺醯基； C_1 - C_8 -烷基磺醯基胺基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷基磺醯基胺基；胺磺醯基； C_1 - C_8 -烷基胺磺醯基與二- C_1 - C_8 -烷基胺磺醯基組成之群組， R^b 係獨立地選自於由鹵素原子、硝基、羥基、氰基、羧基、胺基、氫硫基、五氟- λ^6 -氫硫基、甲醯

基、胺甲醯基、胺甲酸酯、C₁-C₈-烷基、C₃-C₇-環烷基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基、具有1至5個鹵素原子之C₃-C₇-鹵環烷基、C₂-C₈-烯基、C₂-C₈-炔基、C₁-C₈-烷基胺基、二-C₁-C₈-烷基胺基、C₁-C₈-烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷氧基、C₁-C₈-烷基氫硫基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基氫硫基、C₁-C₈-烷基羰基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基、C₁-C₈-烷基胺甲醯基、二-C₁-C₈-烷基胺甲醯基、C₁-C₈-烷氧基羰基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷氧基羰基、C₁-C₈-烷基羰基氧基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基氧基、C₁-C₈-烷基羰基胺基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基胺基、C₁-C₈-烷基氫硫基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基氫硫基、C₁-C₈-烷基亞磺醯基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基亞磺醯基、C₁-C₈-烷基磺醯基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基磺醯基、C₁-C₈-烷基磺醯基胺基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基磺醯基胺基、胺磺醯基、C₁-C₈-烷基胺磺醯基、及二-C₁-C₈-烷基胺磺醯基組成之群組；

前提是，若R¹為鹵素且R²為鹵素，則R³係選自於由鹵素、氰基、C₁-C₆-烷基、或C₁-C₆-鹵烷基組成之群組。

前提是，若R¹與R²相同且為溴或氯，則R³為氰基或C₁-C₆-鹵烷基或W為硫或R⁴與R⁵不與其連接之碳原子一起形成環丙基。

【0043】 又較佳為，若R³係選自於由鹵素、C₁-C₆-烷基組成之群組。

【0044】 又較佳為式(I)化合物，其中R⁴與R⁵與其連接之碳原子一起形成C₃-C₆-碳環。

【0045】 在另一較佳之具體實施例中，W為氧。

【0046】 又較佳為式(I)化合物，其中Y為氧。

【0047】 在另一較佳之具體實施例中，

R¹係選自於由鹵素、氰基組成之群組；

R²為鹵素；

R^3 係選自於由鹵素、 C_1 - C_6 -烷基組成之群組；

R^4 與 R^5 與其連接之碳原子一起形成 C_3 - C_6 -碳環；

W為氧；

Y為氧。

【0048】在另一較佳之具體實施例中，

R^1 係選自於由Cl、Br、氰基組成之群組；

R^2 為Cl、Br；

R^3 係選自於由H、F、Cl、Br、I、 CH_3 組成之群組；

R^4 與 R^5 與其連接之碳原子一起形成 C_3 -碳環；

W為氧；

Y為氧。

【0049】在另一具體實施例中， R^1 為鹵素、氰基、 C_1 - C_6 -烷基、或 C_1 - C_6 -鹵烷基。在另一具體實施例中， R^1 為鹵素、氰基、 C_1 - C_3 -烷基、或 C_1 - C_3 -鹵烷基。在另一具體實施例中， R^1 為鹵素、氰基、甲基、三氟甲基、或二氟甲基。在另一具體實施例中， R^1 為鹵素。在另一具體實施例中， R^1 為氰基、三氟甲基、或二氟甲基。

【0050】在另一具體實施例中， R^2 為鹵素、氰基、 C_1 - C_6 -烷基、或 C_1 - C_6 -鹵烷基。在另一具體實施例中， R^2 為鹵素、氰基、 C_1 - C_3 -烷基、或 C_1 - C_3 -鹵烷基。在另一具體實施例中， R^2 為鹵素、氰基、甲基、三氟甲基、或二氟甲基。在另一具體實施例中， R^2 為鹵素。在另一具體實施例中， R^2 為氰基、三氟甲基、或二氟甲基。

【0051】在另一具體實施例中， R^3 為氫、鹵素、氰基、 C_1 - C_6 -烷基、或 C_1 - C_6 -鹵烷基。在另一具體實施例中， R^3 為氫、鹵素、氰基、 C_1 - C_3 -烷基、或 C_1 - C_3 -鹵烷基。在另一具體實施例中， R^3 為氫、鹵素、氰基、甲基、三氟甲基、或二氟甲基。在另一具體實施例中， R^3 為鹵素。在另一具體實施例中， R^3 為氫。在另

一具體實施例中， R^3 為氰基、甲基、三氟甲基、或二氟甲基。

【0052】 在另一具體實施例中， R^4 與 R^5 係彼此獨立地選自於由氫、 C_1 - C_6 -烷基、芳基- C_1 - C_6 -烷基、或 C_3 - C_6 -碳環組成之群組，其中非環 R^4 、 R^5 基可經一或多個 R^a 取代基取代且其中環 R^4 、 R^5 基可經一或多個 R^b 取代基取代。在另一具體實施例中， R^4 與 R^5 與其連接之碳原子一起形成 C_3 - C_6 -碳環或3至6員雜環，其中該 C_3 - C_6 -碳環與3至6員雜環可經一或多個 R^b 取代基取代。在另一具體實施例中， R^4 與 R^5 與其連接之碳原子一起形成 C_3 - C_6 -碳環，其中該 C_3 - C_6 -碳環可經一或多個 R^b 取代基取代。在另一具體實施例中， R^4 與 R^5 與其連接之碳原子一起形成環丙基或環丁基，其中該環丙基或環丁基可經一或多個 R^b 取代基取代。

【0053】 在另一具體實施例中，W為氧。在另一具體實施例中，W為硫。
在另一具體實施例中，Y為氧。在另一具體實施例中，Y為硫。

【0054】 亦較佳為，在實驗章節中揭示之化合物I.01至I.26。

【0055】 本文不包括由違反自然法則之組合所得的化合物，因此本領域技術人員基於他/她的專業知識將其排除在外。舉例而言，排除具有三或多個相鄰氧原子的環結構。

【0056】 依據取代基之本質，式(I)化合物可以不同的立體異構物形式存在。彼等立體異構物為，舉例而言，鏡像異構物、非鏡像異構物、構型異構物、或幾何異構物。據此，本發明包括純的立體異構物及彼等異構物之任何混合物。當化合物可以二或多個互變異構物形式平衡存在時，藉由一互變異構物之描述引用該化合物時，應視為包括所有互變異構物形式。

【0057】 依據化合物中雙鍵之數目，本發明之任一化合物亦可以一或多個幾何異構物形式存在。雙鍵或環之取代基本質之幾何異構物可以順式(= Z-)或反式(= E-)形式存在。因此，本發明同樣地有關所有比例之所有幾何異構物與所有可能的混合物。

【0058】 式(I)化合物可適當地為其游離形式、鹽類形式、N-氧化物形式、

或溶劑合物形式(如水合物)。

【0059】 依據取代基之性質，式(I)化合物可以游離化合物及/或其鹽類(如農業化學上活性鹽類)之形式存在。

【0060】 農業化學上活性鹽類包括有機酸與無機酸之酸加成鹽類，以及慣用鹼基之鹽類。無機酸之實例為鹵化酸(如氟化氫、氯化氫、溴化氫、及碘化氫)、硫酸、磷酸、及硝酸，以及酸性鹽類(如硫酸氫鈉與硫酸氫鉀)。適用之有機酸包括，舉例而言，甲酸、碳酸、及烷酸(如乙酸、三氟乙酸、三氯乙酸、及丙酸)，以及乙醇酸、硫基氰酸、乳酸、琥珀酸、檸檬酸、苯甲酸、肉桂酸、草酸、具有6至20個碳原子之飽和或單或二不飽和脂肪酸、烷基硫酸單酯、烷基磺酸(具有1至20個碳原子之直鏈或支鏈烷基之磺酸)、芳基磺酸或芳基二磺酸(芳族基，如苯基與萘基，其具有一或二個磺酸基團)、烷基膦酸(具有1至20個碳原子之直鏈或支鏈烷基之膦酸)、芳基膦酸、或芳基二膦酸(芳族基，如苯基與萘基，其具有一或二個膦酸基)，其中烷基與芳基可具有進一步之取代基，如對甲苯磺酸、柳酸、對胺基柳酸、2-苯氧苯甲酸、2-乙醯氧苯甲酸等。

【0061】 式(I)化合物之溶劑合物或其鹽類為化合物與溶劑之化學計量組成物。

【0062】 式(I)化合物可以多晶形及/或非晶形之形式存在。晶形形式包括非溶劑合晶形形式、溶劑合物、及水合物。

【0063】 本發明亦有關揭示於表1之任一式(I)化合物以及其在作物保護之用途(即用於防治植物或植物部位上的植物致病性真菌及/或細菌)。

【0064】 本發明之另一態樣係有關一包含本發明之至少一式(I)化合物與至少一農業上適用之助劑的組成物。

【0065】 本發明之另一態樣係有關一用於防治細菌性及/或真菌性病害之方法，其包含將本發明之至少一式(I)化合物或本發明之組成物施加至植物、植物部位、種子、果實、或植物生長之土壤的步驟。

【0066】 本發明之另一態樣係有關本發明之化合物或本發明之組成物在植物或植物部位上防治細菌性及/或真菌性病害之用途。較佳地，其係用於在植物或植物部位上防治真菌性病害。

【0067】 本發明之另一態樣係有關本發明之化合物或本發明之組成物在植物或植物部位上防治線蟲之用途。

【0068】 本發明之另一態樣係有關本發明之化合物或本發明之組成物在植物或植物部位上防治病毒之用途。

【0069】 較佳地，本發明之化合物或組成物係用於對抗：由白粉病(powdery mildew)病原體引起的病害，如蘋果白澀病菌種(*Podosphaera species*)(如蘋果白澀病菌(*Podosphaera leucotricha*))、白粉病菌種(*Sphaerotheca species*)(如胡瓜白粉病(*Sphaerotheca fuliginea*))；由銹病病原體引起的病害，如豌豆銹病菌種(*Uromyces species*)(如菜豆黑銹病菌(*Uromyces appendiculatus*))；由卵菌類(Oomycetes)族群病原體引起的病害，如墓萄露菌病菌種(*Peronospora species*)(如油菜露菌病菌(*Peronospora parasitica*))、疫病菌種(*Phytophthora species*)(如馬鈴薯腐疫病菌(*Phytophthora infestans*))、露菌病菌種(*Plasmopara species*)(如葡萄露菌病菌(*Plasmopara viticola*))、白粉病菌種(*Pseudoperonospora species*)(如啤酒花藤白病菌(*Pseudoperonospora humuli*)或瓜類露菌病菌(*Pseudoperonospora cubensis*))、草苗立枯病菌種(*Pythium species*)(如番薯白腐病菌(*Pythium ultimum*))；由諸如鏈隔孢菌種(*Alternaria species*)(如馬鈴薯夏疫病菌(*Alternaria solani*))、恭菜斑點病菌種(*Cercospora species*)(如甜菜褐斑病菌(*Cercospora beticola*))、棉黑斑病菌種(*Colletotrichum species*)(如菜豆炭疽病菌(*Colletotrichum lindemuthianum*))、蘋果黑星病菌種(*Venturia species*)(如蘋果黑星病菌(*Venturia inaequalis*))引起的葉斑病與葉枯萎病；由細菌病原體引起的病害，如黃單胞菌種(*Xanthomonas species*)(如十字花科黑腐病菌)、假單胞菌種(*Pseudomonas species*)(如黃蜀葵斑點細菌病菌(*Pseudomonas syringae* pv. *tomato*))、伊文氏桿菌種(*Erwinia species*)(如梨及蘋果

火傷病菌(*Erwinia amylovora*)、黃龍病菌種(*Liberibacter species*)(如柑桔黃龍病菌(*Liberibacter Candidatus*))、羅爾斯頓氏菌種(*Ralstonia species*)(如青枯病羅爾斯頓氏菌(*Ralstonia solanacearum*))。

【0070】 依據本發明之進一步態樣，本發明之化合物或組成物係作為植物防禦活化劑。本發明之植物防禦誘導劑為刺激植物自身防禦系統之化合物或組成物。

用於製備式(I)化合物之方法

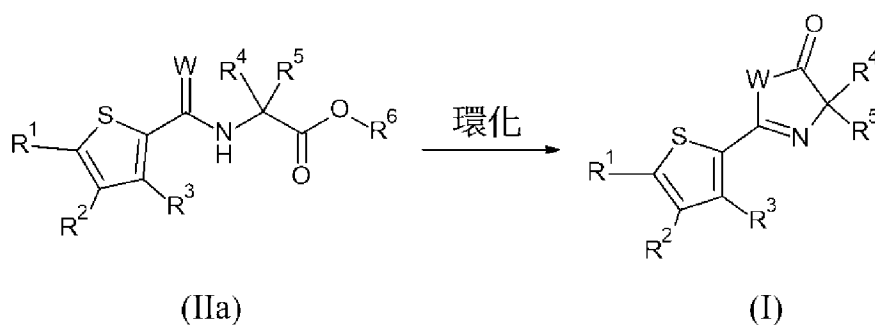
【0071】 本發明係有關用於製備式(I)化合物之方法。式(I)化合物可藉由類似於*Helvetica Chimica Acta*, 69(2), 374-388, 1986；*Helvetica Chimica Acta*, 70(4), 1001-1011, 1987；*Chimia*, 36(2), 78-81, 1982；*Helvetica Chimica Acta*, 71(8), 2071-2084, 1988；*Heterocyclic Communications*, 9(2), 129-134；2003；WO2007080885；WO2007003536；*Chemical Communications (Cambridge, United Kingdom)*, 55(39), 5547-5550；2019；以及其中之其他參考資料中所述之已知方法的各種路徑，或者下文所述之一或多個下列合成路徑及實驗部分進行製備。

式(I)化合物之一般合成路徑

【0072】 除非另有指明，否則在以下， R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、W、Y具有與上述式(I)化合物相同的含義。

方法A

【0073】 本文所定義之式(I)化合物可利用方法A由式(IIa)化合物(其中 R^6 為氫)或其鹽類之一者藉由下列反應流程所示之環化反應所製備：



方法A

【0074】方法A之進行可如 *Journal of Heterocyclic Chemistry*, 25(1), 209-215; 1988 ; WO 2007003536中所述。

【0075】若合適，方法A可在適用之布忍斯特酸(Brønsted acid)、路易士酸、或其他縮合劑存在下進行，若合適，在適用之酸黏合劑存在下進行，若合適，在溶劑存在下進行。

【0076】用於進行方法A之適用路易士酸可為無機與有機路易士酸，其常規用於此類反應。偏好為使用金屬鹵化物，如氯化鋁(III)、氯化鐵(III)、氯化鋅(II)、四氯化鈦、三氟化硼；三氟甲磺酸酯，如三氟甲磺酸酯銦(III)、三氟甲磺酸酯鉍(III)、或三氟甲磺酸酯鎢(III)，以及碘。

【0077】用於進行方法A之適用布忍斯特酸可為無機與有機布忍斯特酸，其常規用於此類反應。偏好為使用鹵化氫，如氯化氫或溴化氫；磺酸，如對甲苯磺酸、樟腦磺酸、甲烷磺酸、或三氟甲烷磺酸，以及多磷酸、磷酸、硫酸、亞硫酸氫鉀、三氟乙酸、或乙酸。

【0078】用於進行方法A之其他適用縮合劑可選自於由酸鹵化物形成劑，如光氣、三溴化磷、三氯化磷、五氯化磷、三氯化磷氧化物、草醯氯、或硫醯氯；酸酐形成劑，如氯甲酸乙酯、氯甲酸甲酯、氯甲酸異丙酯、氯甲酸異丁酯、或甲烷磺醯基氯化物；酸酐，如三氟乙酸酐或乙酸酐；碳二亞胺，如N,N'-二環己基碳二亞胺(DCC)、N-(3-二甲基胺基丙基)-N'-乙基碳二亞胺鹽酸鹽(EDC)；或者其他常規縮合劑，如五氧化二磷、多磷酸、雙(2-側氧基-3-噁唑啉基)膦酸氯化物、1-[雙(二甲基胺基)亞甲基]-1H-1,2,3-三唑[4,5-b] 3-氧化六氟磷酸吡啶鎗(HATU)、2-(1H-苯并三唑-1-基)-1,1,3,3-四甲基四氟硼酸銨(TBTU)、(1-氰基-2-乙氧基-2-側氧基亞乙基胺基氧基)二甲基胺基-嗎啉基-碳六氟磷酸酯、N,N'-羰基-二咪唑、2-乙氧基-N-乙氧基羰基-1,2-二氫喹啉(EEDQ)、三苯基膦/四氯甲烷、4-(4,6-二甲氧基[1.3.5]-噻-2-基)-4-甲基嗎啉氯化物水合物、雙(2-側氧基-3-噁唑啉基)膦酸氯化物(BOP-Cl)、溴-三吡咯啉鎗六氟磷酸酯(PyBroP)、2-氯-1,3-二甲基

咪唑啉氯化物(DMC)、或丙烷膦酸酐(T3P)所組成之非限制的列表。

【0079】 用於進行本發明方法A之適用酸黏合劑為在每一情況下所有常規用於此類反應之無機鹼基與有機鹼基。偏好為鹼性金屬碳酸鹽，如碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸鈣、碳酸氫鈣、碳酸氫鈉；鹼土金屬乙酸鹽，如乙酸鈉、乙酸鉀、乙酸鈣；以及三級胺，如三甲基胺、三乙基胺、二異丙基乙基胺、三丁基胺、N,N-二甲基苯胺、N-甲基哌啶、N,N-二甲基吡啶-4-胺、二氮雜雙環辛烷(DABCO)、二氮雜雙環壬烯(DBN)、或二氮雜雙環十一碳烯(DBU)；或者芳族鹼基，如吡啶。

【0080】 用於進行方法A之適用溶劑並未特別侷限。其可為常規之惰性有機溶劑，只要其不溶解與其反應之化合物或不表現出任何與其之特定交互作用即可。偏好為使用任意地鹵化的脂肪族、脂環族、或芳族碳氫化合物，如石油醚、戊烷、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯、十氫萘、ISOPAR™ E或ISOPAR™ G、氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷、或三氯乙烷；醚類，如乙醚、二異丙醚、甲基三級丁基醚、甲基三級戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、2-甲基四氫呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷、或苯甲醚；腈類，如乙腈、丙腈、正丁腈或異丁腈、苄腈；醯胺類，如N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯苯胺、N-甲基氫吡咯酮、或六甲基磷酸三醯胺；脲類，如1,3-二甲基-3,4,5,6-四氫-2(1H)-嘧啶酮；酯類，如乙酸甲酯或乙酸乙酯；亞砷類，如二甲基亞砷；或者砷類，如環丁砷；以及其混合物。

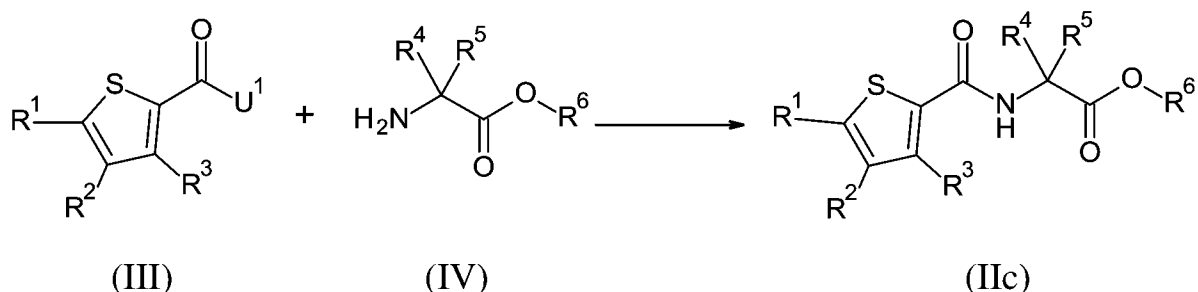
【0081】 方法A可在惰性環境中進行。當進行方法A時，每莫耳之式(IIa)化合物可使用0.01至5莫耳百分比之適用酸或縮合劑，且每莫耳之式(IIa)化合物可使用0.01至5莫耳之酸黏合劑。亦可使用其他比例之反應組分。利用已知之方法進行追蹤。

【0082】 利用已知之方法(如水解)，可從式(IIb)化合物(其中R⁶代表C₁-C₆-

烷基)製備式(IIa)化合物(其中 R^6 代表氫)。水解試劑之實例包括氫氧化鋰、氫氧化鉀、氫氧化鈉、三甲基氫氧化錫。水解之進行可如 WO2008157844 ; WO2006002099 ; WO20050256107 ; Angewandte Chemie, International Edition (2005), 44(9), 1378-1382中所述。

方法B

【0083】 式(IIc)化合物(其中 R^6 代表氫或 C_1 - C_6 -烷基)可利用方法B製備，其包含將式(III)化合物或其鹽類之一者與式(IV)化合物或其鹽類之一者反應的步驟，如下列反應流程所示：



方法B

其中 U^1 為鹵素、羥基或 C_1 - C_6 -烷氧基。

【0084】 當 U^1 代表羥基時，方法B係有利地在縮合劑存在下進行。適用之縮合劑可選自於由酸鹵化物形成劑，如光氣、三溴化磷、三氯化磷、五氯化磷、三氯化磷氧化物、草醯氯、或硫醯氯；酸酐形成劑，如氯甲酸乙酯、氯甲酸甲酯、氯甲酸異丙酯、氯甲酸異丁酯、或甲烷磺醯基氯化物；碳二亞胺，如N,N'-二環己基碳二亞胺(DCC)、N-(3-二甲基胺基丙基)-N'-乙基碳二亞胺鹽酸鹽(EDC)；或者其他常規縮合劑，如五氧化二磷、多磷酸、雙(2-側氧基-3-噁唑啉基)磷酸氯化物、1-[雙(二甲基胺基)亞甲基]-1H-1,2,3-三唑[4,5-b] 3-氧化六氟磷酸吡啶鎢(HATU)、2-(1H-苯并三唑-1-基)-1,1,3,3-四甲基四氟硼酸銨(TBTU)、(1-氰基-2-乙氧基-2-側氧基亞乙基胺基氧基)二甲基胺基-嗎啉基-碳六氟磷酸酯、N,N'-羰基-二咪唑、2-乙氧基-N-乙氧基羰基-1,2-二氫喹啉(EEDQ)、三苯基膦/四氫甲烷、4-(4,6-二甲氧基[1.3.5]-三嗪-2-基)-4-甲基嗎啉氯化物水合物、雙(2-側氧基-3-

噁唑啉基)磷酸氯化物(BOP-Cl)、溴-三吡咯啉磷六氟磷酸酯(PyBroP)、2-氯-1,3-二甲基咪唑啉氯化物(DMC)、丙烷膦 酸酐(T3P)、及3-(二乙氧基磷醯基氧基)-1,2,3-苯并三嗪-4(3*H*)-酮(DEPBT)所組成之非限制的列表。

【0085】 當U¹代表鹵素時，方法B係有利地在酸黏合劑存在下進行。用於進行方法B之適用酸黏合劑為在每一情況下所有常規用於此類反應之無機鹼基與有機鹼基。偏好為鹼性金屬碳酸鹽，如碳酸銨、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鉀、碳酸氫鈉；鹼土金屬乙酸鹽，如乙酸鈉、乙酸鉀、乙酸鈣；以及三級胺，如三甲基胺、三乙基胺、二異丙基乙基胺、三丁基胺、N,N-二甲基苯胺、N-甲基哌啶、N,N-二甲基吡啶-4-胺、二氮雜雙環辛烷(DABCO)、二氮雜雙環壬烯(DBN)、或二氮雜雙環十一碳烯(DBU)；或者芳族鹼基，如吡啶。

【0086】 當U¹代表C₁-C₆-烷氧基時，方法B可以過量之胺組分，在任意地路易士酸(如三甲基鋁)存在下進行。

【0087】 若合適，方法B可在鹼基存在下進行，且若合適，在溶劑(較佳地無水條件)存在下進行。

【0088】 用於進行方法B之適用溶劑並未特別侷限。其可為常規之惰性有機溶劑，只要其不溶解與其反應之化合物或不表現出任何與其之特定交互作用即可。偏好為使用任意地鹵化的脂肪族、脂環族、或芳族碳氫化合物，如石油醚、戊烷、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯、十氫萘、ISOPAR™ E或ISOPAR™ G、氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷、或三氯乙烷；醚類，如乙醚、二異丙醚、甲基三級丁基醚、甲基三級戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、2-甲基四氫呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷、或苯甲醚；腈類，如乙腈、丙腈、正丁腈或異丁腈、苄腈；醯胺類，如N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯苯胺、N-甲基氫吡咯酮、或六甲基磷酸三醯胺；脲類，如1,3-二甲基-3,4,5,6-四氫-2(1*H*)-嘧啶酮；酯類，如乙酸甲酯或乙酸乙酯；亞砷類，如二甲基亞砷；或者砷類，如環丁砷；以及其混合

物。

【0089】 方法B可在惰性環境(如氬氣或氮氣環境)中進行。當進行方法B時，每莫耳之式(III)化合物可使用1莫耳或更多之式(IV)化合物與1至5莫耳之鹼。亦可使用其他比例之反應組分。利用已知之方法進行追蹤。

【0090】 式(IV)化合物係商業上可得，或可利用已知之方法製備。

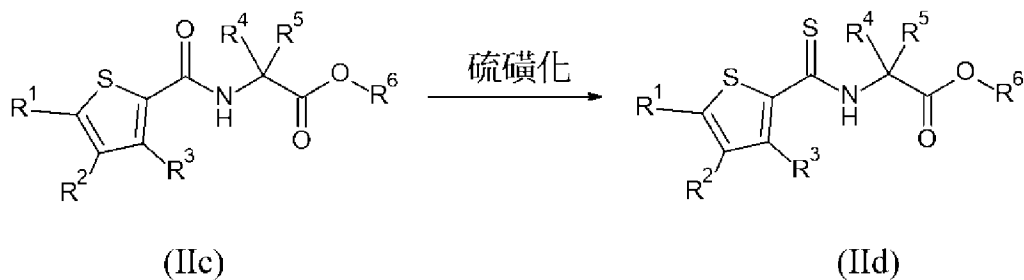
【0091】 式(IIIa)化合物(其中 U^1 代表羥基)係商業上可得，可利用已知之方法(如鹼水解)從式(IIIb)化合物(其中 U^1 代表 C_1 - C_6 -烷氧基)製備，或可利用已知之方法製備(*Beilstein J. Org. Chem.* 2007, 3, No. 23)。

【0092】 式(IIIc)化合物(其中 U^1 代表鹵素)係商業上可得，或可利用已知之方法從式(IIIa)化合物(其中 U^1 代表羥基)製備。

【0093】 式(IIIb)化合物(其中 U^1 代表 C_1 - C_6 -烷氧基)可利用已知之方法從式(IIIa)化合物(其中 U^1 代表羥基)製備。

方法C

【0094】 式(IIId)化合物(其中 R^6 代表氫或 C_1 - C_6 -烷基)可利用方法C從式(IIc)化合物(其中 R^6 代表氫或 C_1 - C_6 -烷基)藉由進行硫磺化(thionation)反應所製備，如下列反應流程所示：



方法C

【0095】 本發明之方法C係於硫磺化試劑存在下進行。

【0096】 用於進行本發明方法C之適用硫磺化試劑可為硫(S)、氫硫酸(H_2S)、硫化鈉(Na_2S)、氫硫化鈉($NaHS$)、三硫化硼(B_2S_3)、雙(二乙基鋁)硫化物($(AlEt_2)_2S$)、硫化銨($(NH_4)_2S$)、五硫化二磷(P_2S_5)、勞森試劑(Lawesson's

reagent)(2,4-雙(4-甲氧基苯基)-1,2,3,4-二硫二磷烷2,4-二硫化物)、或聚合物為主之硫磺化試劑，如Journal of the Chemical Society, Perkin 1 (2001), 358中所述，其係任意地在催化或化學計量或或過量之鹼基(如無機鹼基與有機鹼基)數量存在下進行。偏好為使用鹼性金屬碳酸鹽，如碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鉀、碳酸氫鈉；雜環芳族鹼基，如吡啶、甲吡啶、二甲吡啶、三甲吡啶；以及三級胺，如三甲基胺、三乙基胺、三丁基胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基吡啶-4-胺、或N-甲基-哌啶。

【0097】 用於進行本發明方法C之適用溶劑可為常規之惰性有機溶劑。偏好為使用任意地鹵化的脂肪族、脂環族、或芳族碳氫化合物，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、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，如乙醚、二異丙醚、甲基三級丁基醚、甲基三級戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、或1,2-二乙氧基乙烷；腈類，如乙腈、丙腈、正丁腈或異丁腈、或苄腈；亞硫溶劑，如環丁砜或二硫化碳。

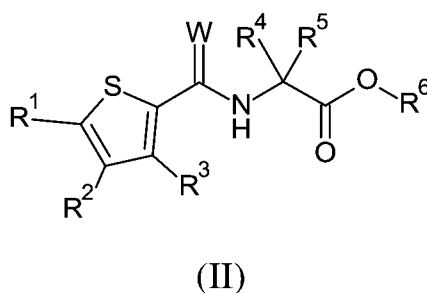
【0098】 當進行本發明方法C時，每莫耳之醯胺反應劑(IIc)可使用1莫耳或更多之硫磺化試劑之硫當量與1至3莫耳之鹼。

【0099】 亦可能使用其他比例之反應組分。實施係利用已知之方法進行。

用於式(I)化合物之製備的中間物

【0100】 本發明係有關用於式(I)化合物之製備的中間物。

【0101】 提供式(II)化合物：



其中

R^1 、 R^2 係彼此獨立地選自於由鹵素、氰基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -鹵烷基組成之群組；

R^3 係選自於由氫、鹵素、氰基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -鹵烷基組成之群組；

W係獨立地選自於由氧、硫組成之群組；

R^4 與 R^5 係彼此獨立地選自於由氫、 C_1 - C_6 -烷基、芳基- C_1 - C_6 -烷基、或 C_3 - C_6 -碳環組成之群組，其中非環 R^4 、 R^5 基可經一或多個 R^a 取代基取代且其中環 R^4 、 R^5 基可經一或多個 R^b 取代基取代；或者 R^4 與 R^5 與其連接之碳原子一起形成 C_3 - C_6 -碳環或3至6員雜環，其中該 C_3 - C_6 -碳環與3至6員雜環可經一或多個 R^b 取代基取代， R^a 係獨立地選自於由硝基、羥基、氰基、羧基、胺基、氫硫基、五氟- λ^6 -氫硫基、甲醯基、胺甲醯基、胺甲酸酯、 C_3 - C_7 -環烷基、具有1至5個鹵素原子之 C_3 - C_7 -鹵環烷基、 C_1 - C_8 -烷基胺基、二- C_1 - C_8 -烷基胺基、 C_1 - C_8 -烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷氧基、 C_1 - C_8 -烷基氫硫基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷基氫硫基、 C_1 - C_8 -烷基羰基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷基羰基、 C_1 - C_8 -烷基胺甲醯基、二- C_1 - C_8 -烷基胺甲醯基、 C_1 - C_8 -烷氧基羰基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷氧基羰基、 C_1 - C_8 -烷基羰基氧基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷基羰基氧基、 C_1 - C_8 -烷基羰基胺基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷基羰基胺基、 C_1 - C_8 -烷基亞磺醯基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷基亞磺醯基、 C_1 - C_8 -烷基磺醯基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷基磺醯基； C_1 - C_8 -烷基磺醯基胺基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷基磺醯基胺基；胺磺醯基； C_1 - C_8 -烷基胺磺醯基與二- C_1 - C_8 -烷基胺磺醯基組成之群組， R^b 係獨立地選自於由鹵素原子、硝基、羥基、氰基、羧基、胺基、氫硫基、五氟- λ^6 -氫硫基、甲醯基、胺甲醯基、胺甲酸酯、 C_1 - C_8 -烷基、 C_3 - C_7 -環烷基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷基、具有1至5個鹵素原子之 C_3 - C_7 -鹵環烷基、 C_2 - C_8 -烯基、 C_2 - C_8 -炔基、 C_1 - C_8 -烷基胺基、二- C_1 - C_8 -烷基胺基、 C_1 - C_8 -烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷氧基、 C_1 - C_8 -烷基氫硫基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 -鹵烷基氫硫基、

C₁-C₈-烷基羰基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基、C₁-C₈-烷基胺甲醯基、二-C₁-C₈-烷基胺甲醯基、C₁-C₈-烷氧基羰基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷氧基羰基、C₁-C₈-烷基羰基氧基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基氧基、C₁-C₈-烷基羰基胺基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基胺基、C₁-C₈-烷基氫硫基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基氫硫基、C₁-C₈-烷基亞磺醯基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基亞磺醯基、C₁-C₈-烷基磺醯基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基磺醯基、C₁-C₈-烷基磺醯基胺基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基磺醯基胺基、胺磺醯基、C₁-C₈-烷基胺磺醯基、及二-C₁-C₈-烷基胺磺醯基組成之群組；

R⁶係選自於由氫、C₁-C₆-烷基組成之群組；

前提是，若R¹為鹵素且R²為鹵素，則R³係選自於由鹵素、氰基、C₁-C₆-烷基、或C₁-C₆-鹵烷基組成之群組。

前提是，若R¹與R²相同且為溴或氯，則R³為氰基或C₁-C₆-鹵烷基或W為硫或R⁴與R⁵不與其連接之碳原子一起形成環丙基。

組成物與調配物

【0102】 本發明進一步有關一組成物，特別是用於防治有害微生物之組成物，其包含一或多個式(I)化合物。組成物較佳地為殺真菌組成物。

【0103】 組成物典型上包含一或多個式(I)化合物與一或多個可接受之載劑，特別是一或多個農業上可接受之載劑。

【0104】 載劑通常為惰性之固體或液體、天然或合成之有機或無機物質。載劑通常可改進化合物在諸如植物、植物部位、或種子之應用。適用之固體載劑之實例包括但不侷限於，銨鹽、天然岩粉(如高嶺土、黏土、滑石、白堊、石英、鎂鋁海泡石、蒙脫石、及矽藻土)、及合成岩粉(如細分之二氧化矽、氧化鋁、及矽酸鹽)。典型上用於製備顆粒之適用固體載劑之實例包括但不侷限於，粉碎與分級之天然岩石，如方解石、大理石、浮石、海泡石、及白雲石；無機與有

機粉之合成顆粒及有機材料(如紙、木屑、椰子殼、玉米穗、及煙梗)之顆粒。適用之液體載劑之實施例包括但不侷限於水、有機溶劑、及其結合物。適用之溶劑之實施例包括極性與非極性有機化學液體，如源自芳族與非芳族之碳氫化合物類(如環己烷、石蠟、烷基苯、二甲苯、甲苯烷基萘、氯化芳族、或氯化脂肪族碳氫化合物如氯苯、氯乙烯、或亞甲基氯化物)、醇類與多元醇類(其亦可任意地經取代、經醚化、及/或經酯化，如丁醇或乙二醇)、酮類(如丙酮、甲乙酮、甲基異丁基酮、或環己酮)、酯類(包括脂肪與油脂)與(聚)醚類、未經取代與經取代之胺類、醯胺類(如二甲基甲醯胺)、內醯胺類(如N-烷基氫吡咯酮)與內酯類、礬類、及亞礬類(如二甲基亞礬)。載劑亦可為液化之氣態增效劑，亦即在標準溫度與標準壓力下為氣態的液體，如氣溶膠推進劑，如鹵碳氫化合物、丁烷、丙烷、氮氣、及二氧化碳。載劑量之範圍通常為組成物的1至99.99重量%，較佳地5至99.9重量%，更佳地10至99.5重量%，且最佳地20至99重量%。

【0105】 組成物可進一步包含一或多個可接受之助劑，其常規用於調配組成物(如農業化學組成物)，如一或多個界面活性劑。

【0106】 界面活性劑可為離子性(陽離子性或陰離子性)或非離子性界面活性劑，如離子性或非離子性乳化劑、泡沫形成劑、分散劑、濕潤劑、及其任一混合物。適用之界面活性劑之實施例包括但不侷限於，聚丙烯酸之鹽類、本質磺酸之鹽類、苯酚磺酸或萘磺酸之鹽類、乙烯及/或丙烯氧化物與脂肪醇之聚縮合物、脂肪酸或脂肪胺(聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚，如烷基芳基聚乙二醇醚)、經取代之酚類(較佳地烷基酚或芳基酚)、磺基琥珀酸酯之鹽類、牛磺酸衍生物(較佳地烷基牛磺酸酯)、聚乙氧基化醇或酚之磷酸酯類、多元醇之脂肪酯類、及含有硫酸鹽、磺酸鹽、磷酸鹽之化合物衍生物(如烷基磺酸鹽、烷基硫酸鹽、芳基磺酸鹽)及蛋白質水解物、木質亞硫酸酯廢液、及甲基纖維素。當式(I)化合物及/或載劑不溶於水且以水施加時，典型上使用界面活性劑。隨後，界面活性劑之量的範圍通常為組成物的5至40重量%。

【0107】常規用於調配農業化學組成物之助劑的進一步實例包括防水劑、乾燥劑、黏合劑(黏著劑、增黏劑、固定劑(如羧甲基纖維素)、粉末、顆粒、或膠乳形式之天然與合成聚合物(如阿拉伯膠、聚乙基醇、及聚乙基乙酸酯)、天然磷脂質(如腦磷脂與卵磷脂)與合成磷脂質、聚乙基氫吡咯酮、聚乙基乙酸酯、聚乙基醇、及羥乙基纖維素)、增稠劑、安定劑(如冷安定劑、防腐劑、抗氧化劑、光安定劑、或其他改進化學及/或物理安定性的試劑)、染料或顏料(如無機顏料，如氧化鐵、氧化鈦、及普魯士藍；有機染料，如茜素(alizarin)、偶氮、及金屬酞青素染料)、消泡劑(如聚矽氧消泡劑與硬脂酸鎂)、防腐劑(如雙氯酚與苧醇半縮醛)、二次增稠劑(纖維素衍生物、丙烯酸衍生物、黃原膠、改性黏土、及細分之二氧化矽)、黏著劑、吉貝素、及加工助劑、礦物油與植物油、香料、蠟、營養素(包括微量營養素，如鐵、錳、硼、銅、鈷、鋁、及鋅之鹽類)、保護性膠體、觸變物質、滲透劑、螯合劑、及錯合物形成劑。

【0108】助劑之選擇與式(I)化合物之所欲施加方式及/或物理性質有關。此外，可選擇助劑，以賦予組成物特定的性質(技術、物理、及/或生物性質)或使用由此製備之形式。助劑之選擇使得可依據特定需要定制組成物。

【0109】組成物可為任何常規之形式，如溶液(如水溶液)、乳劑、可濕性粉末、水基與油基懸浮液、粉末、粉劑、糊劑、可溶性粉劑、可溶性顆粒、用於撒播之顆粒、懸浮乳劑濃縮物、以本發明化合物浸漬之天然或合成產物、肥料、及聚合物質之微膠囊。式(I)化合物可以懸浮、乳化、或溶解之形式存在。

【0110】組成物可以即用型調配物供應終端用戶，亦即可利用適用之裝置(如噴霧或撒粉裝置)將組成物直接施加至植物或種子。或者，組成物可以濃縮物形式供應終端用戶，其在使用前必須稀釋(較佳地以水稀釋)。

【0111】組成物可以常規方式製備，如將式(I)化合物與一或多個適用之助劑(如上述揭示)混合。

【0112】組成物通常含有0.01至99重量%，0.05至98重量%，較佳地0.1至95

重量%，更佳地0.5至90重量%，最佳地1至80重量%的式(I)化合物。

【0113】 化合物與包含其之組成物可混合其他活性成分，如殺真菌劑、殺菌劑、殺蟎劑、殺線蟲劑、殺蟲劑、除草劑、肥料、生長調節劑、安全劑、或訊息化合物。此可容許活性範圍變寬，或防止產生抗藥性。已知之殺真菌劑、殺蟲劑、殺蟎劑、殺線蟲劑、及殺菌劑之實例係揭示於Pesticide Manual，第17th版。

【0114】 本文中以俗名指定之活性成分係已知，且描述於The Pesticide Manual (16th Ed. British Crop Protection Council) 或可在網路（如 www.alanwood.net/pesticides）上搜尋。

【0115】 當化合物(A)或化合物(B)可以互變異構物形式存在時，此化合物在上下文中應理解為在適當情況下亦包括相應之互變異構物形式，即使在每一情況下未特別提及時亦然。

【0116】 可混合式(I)化合物與本發明組成物之殺真菌劑之實例為：

1) 麥角固醇(ergosterol)生合成之抑制劑，如(1.001) 環克座(cyproconazole)、(1.002) 待克利(difenoconazole)、(1.003) 依普座(epoxiconazole)、(1.004) 環醯菌胺(fenhexamid)、(1.005) 苯鏽啉(fenpropidin)、(1.006) 芬普福(fenpropimorph)、(1.007) 胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)、(1.008) 氟喹唑(fluquinconazole)、(1.009) 護汰芬(flutriafol)、(1.010) 依滅列(imazalil)、(1.011) 依滅列硫酸鹽、(1.012) 種菌唑(ipconazole)、(1.013) 滅特座(metconazole)、(1.014) 邁克尼(myclobutanil)、(1.015) 巴克素(paclobutrazol)、(1.016) 咪醯胺(prochloraz)、(1.017) 普克利(propiconazole)、(1.018) 丙硫菌唑(prothioconazole)、(1.019) 啉菌唑(pyrisoxazole)、(1.020) 螺環菌胺(spiroxamine)、(1.021) 得克利(tebuconazole)、(1.022) 四克利(tetraconazole)、(1.023) 三泰隆(triadimenol)、(1.024) 三得芬(tridemorph)、(1.025) 滅菌唑(triticonazole)、(1.026)(1R,2S,5S)-5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)環戊醇、(1.027)(1S,2R,5R)-5-(4-氯苄

基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)環戊醇、(1.028)(2R)-2-(1-氯環丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯環丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.029)(2R)-2-(1-氯環丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯環丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.030)(2R)-2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.031)(2S)-2-(1-氯環丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯環丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.032)(2S)-2-(1-氯環丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯環丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.033)(2S)-2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.034)(R)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.035)(S)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.036) [3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.037) 1-({(2R,4S)-2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-4-甲基-1,3-二噁草烷-2-基}甲基)-1H-1,2,4-三唑、(1.038) 1-({(2S,4S)-2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-4-甲基-1,3-二噁草烷-2-基}甲基)-1H-1,2,4-三唑、(1.039) 1-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基 硫基氰酸酯、(1.040) 1-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基 硫基氰酸酯、(1.041) 1-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基 硫基氰酸酯、(1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯

基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.050) 2-[1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.051) 2-[2-氯-4-(2,4-二氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.052) 2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.053) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.054) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)戊-2-醇、(1.055) 甲芬氟康唑(mefentrifluconazole)、(1.056) 2-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.057) 2-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.058) 2-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.059) 5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)環戊醇、(1.060) 5-(allyl氫硫基)-1-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(1.061) 5-(烯丙基氫硫基)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(1.062) 5-(烯丙基氫硫基)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(1.063) N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]氫硫基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.064) N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(2,2,2-三氟乙氧基)苯基]氫硫基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.065) N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(2,2,3,3-四氟丙氧基)苯基]氫硫基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.066) N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(五氟乙氧基)苯基]氫硫基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.067) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(1,1,2,2-四氟乙基)氫硫基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.068) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(2,2,2-三氟乙基)氫硫基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.069) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(2,2,3,3-四氟丙基)氫硫基]苯氧基})

苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.070) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(五氟乙基)氫硫基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.071) N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.072) N'-(4-{[3-(二氟甲氧基)苯基]氫硫基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.073) N'-(4-{3-[(二氟甲基)氫硫基]苯氧基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.074) N'-[5-溴-6-(2,3-二氫-1H-茚-2-基氧基)-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.075) N'-{4-[(4,5-二氯-1,3-噻唑-2-基)氧基]-2,5-二甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.076) N'-{5-溴-6-[(1R)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.077) N'-{5-溴-6-[(1S)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.078) N'-{5-溴-6-[(cis-4-異丙基環己基)氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.079) N'-{5-溴-6-[(反-4-異丙基環己基)氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.080) N'-{5-溴-6-[1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.081) 依芬氟康唑(ipfentrifluconazole)、(1.082) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.083) 2-[6-(4-溴苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.084) 2-[6-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.085) 3-[2-(1-氯環丙基)-3-(3-氯-2-氟-苯基)-2-羥基-丙基]咪唑-4-腈、(1.086) 4-[[6-[rac-(2R)-2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羥基-3-(5-硫基-4H-1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苄腈、(1.087) N-異丙基-N'-[5-甲氧基-2-甲基-4-(2,2,2-三氟-1-羥基-1-苯基乙基)苯基]-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.088) N'-{5-溴-2-甲基-6-[(1-丙氧基丙烷-2-基)氧基]吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.089) 2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-2-羥基-3-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙酸甲酯。

2) 複合物 I 或 II 之呼吸鏈之抑制劑，如 (2.001) 苯丙烯氟菌唑 (benzovindiflupyr)、(2.002) 必殺吩(bixafen)、(2.003) 白可列(boscalid)、(2.004) 萎

鏽靈(carboxin)、(2.005) 氟吡菌醯胺(fluopyram)、(2.006) 福多寧(flutolanil)、(2.007) 氟唑菌醯胺(fluxapyroxad)、(2.008) 福拉比(furametpyr)、(2.009) 艾索非他米(isofetamid)、(2.010) 吡唑萘菌胺(isopyrazam)(抗表異構性鏡像異構物1R,4S,9S)、(2.011) 吡唑萘菌胺(抗表異構性鏡像異構物1S,4R,9R)、(2.012) 吡唑萘菌胺(抗表異構性外消旋物1RS,4SR,9SR)、(2.013) 吡唑萘菌胺(順表異構性外消旋物1RS,4SR,9RS與抗表異構性外消旋物1RS,4SR,9SR之混合物)、(2.014) 吡唑萘菌胺(順表異構性鏡像異構物1R,4S,9R)、(2.015) 吡唑萘菌胺(順表異構性鏡像異構物1S,4R,9S)、(2.016) 吡唑萘菌胺(順表異構性外消旋物1RS,4SR,9RS)、(2.017) 噴福芬(penflufen)、(2.018) 吡噻菌胺(penthiopyrad)、(2.019) 吡二氟甲酚(pydiflumetofen)、(2.020) 吡福米(Pyraziflumid)、(2.021) 氟唑環菌胺(sedaxane)、(2.022) 1,3-二甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-羧醯胺、(2.023) 1,3-二甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-羧醯胺、(2.024) 1,3-二甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-羧醯胺、(2.025) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[2'-(三氟甲基)bi苯基-2-基]-1H-吡唑-4-羧醯胺、(2.026) 2-氟-6-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)苯甲醯胺、(2.027) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-羧醯胺、(2.028) 因得路米特(inpyrfluxam)、(2.029) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-羧醯胺、(2.030) 氟茛唑菌胺(fluidapyr)、(2.031) 3-(二氟甲基)-N-[(3R)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(2.032) 3-(二氟甲基)-N-[(3S)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(2.033) 5,8-二氟-N-[2-(2-氟-4-[[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]氧基]苯基)乙基]喹唑啉-4-胺、(2.034) N-(2-環戊基-5-氟苄基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(2.035) N-(2-三級丁基-5-甲基苄基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(2.036) N-(2-三級丁基苄基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯

胺、(2.037) N-(5-氯-2-ethyl苄基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(2.038) 異氟普蘭(isoflucypram)、(2.039) N-[(1R,4S)-9-(二氯亞甲基)-1,2,3,4-四氫-1,4-甲烚萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(2.040) N-[(1S,4R)-9-(di氯亞甲基)-1,2,3,4-四氫-1,4-甲烚萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(2.041) N-[1-(2,4-二氯苄基)-1-甲氧基丙烷-2-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(2.042) N-[2-氯-6-(三氟甲基)苄基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(2.043) N-[3-氯-2-氟-6-(三氟甲基)苄基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(2.044) N-[5-氯-2-(三氟甲基)苄基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(2.045) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-N-[5-甲基-2-(三氟甲基)苄基]-1H-吡啶-4-羧醯胺、(2.046) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-氟-6-異丙基苄基)-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(2.047) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-異丙基-5-甲基苄基)-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(2.048) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-異丙基苄基)-1-甲基-1H-吡啶-4-碳硫醯胺、(2.049) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-異丙基苄基)-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(2.050) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(5-氟-2-異丙基苄基)-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(2.051) N-環丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-4,5-二甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(2.052) N-環丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-氟苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(2.053) N-環丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(2.054) N-環丙基-N-(2-環丙基-5-氟苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(2.055) N-環丙基-N-(2-環丙基-5-甲基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(2.056) N-環丙基-N-(2-環丙基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(2.057) 吡丙炔(pyrapropoyne)、(2.058) N-[rac-(1S,2S)-2-(2,4-二氯苄基)環丁基]-2-(三氟甲基)菸鹼醯胺、(2.059) N-[(1S,2S)-2-(2,4-二氯苄基)環丁基]-2-(三氟甲基)菸鹼醯胺、(2.060) 氟蟲胺

(flubeneteram)。

3) 複合物III之呼吸鏈之抑制劑，如(3.001) 辛唑啉菌胺(ametoctradin)、(3.002) 安美速 (amisulbrom)、(3.003) 亞托敏 (azoxystrobin)、(3.004) 甲香菌酯 (coumethoxystrobin)、(3.005) 丁香菌酯 (coumoxystrobin)、(3.006) 賽座滅 (cyazofamid)、(3.007) 地莫菌胺(dimoxystrobin)、(3.008) 烯肱菌酯(enoxastrobin)、(3.009) 凡殺同(famoxadone)、(3.010) 咪唑菌酮(fenamidone)、(3.011) 氟菌蟬酯 (flufenoxystrobin)、(3.012) 氟啉菌酯 (fluoxastrobin)、(3.013) 克收欣-甲酯 (kresoxim-methyl)、(3.014) 苯氧菌胺 (metominostrobin)、(3.015) 肱醚菌胺 (orysastrobin)、(3.016) 啖氧菌酯(picoxystrobin)、(3.017) 百克敏(pyraclostrobin)、(3.018) 唑胺菌酯(pyrametostrobin)、(3.019) 唑菌酯(pyraoxystrobin)、(3.020) 三氟敏(trifloxystrobin)、(3.021)(2E)-2-{2-[[[(1E)-1-(3-{[(E)-1-氟-2-苯基乙烯基]氧基}苯基)亞乙基]胺基]氧基]甲基]苯基}-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基乙醯胺、(3.022)(2E,3Z)-5-{[1-(4-氯苯基)-1H-吡唑-3-基]氧基}-2-(甲氧基亞胺基)-N,3-二甲基戊-3-烯醯胺、(3.023)(2R)-2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙醯胺、(3.024)(2S)-2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙醯胺、(3.025) 芬匹卡唑(fenpicoxamid)、(3.026) 甲菌胺(mandestrobin)、(3.027) N-(3-乙基-3,5,5-三甲基環己基)-3-甲醯胺基-2-羥基苯甲醯胺、(3.028)(2E,3Z)-5-{[1-(4-氯-2-氟苯基)-1H-吡唑-3-基]氧基}-2-(甲氧基亞胺基)-N,3-二甲基戊-3-烯醯胺、(3.029) 甲基 {5-[3-(2,4-二甲基苯基)-1H-吡唑-1-基]-2-甲基苄基}胺甲酸酯、(3.030) 苯基吡唑(metyltetraprole)、(3.031) 吡啖菌醯胺(florylpicoxamid)。

4) 有絲分裂與細胞分裂之抑制劑，如(4.001) 貝芬替(carbendazim)、(4.002) 乙黴威 (diethofencarb)、(4.003) 噻唑菌胺 (ethaboxam)、(4.004) 氟吡菌胺 (fluopicolide)、(4.005) 賓克隆(pencycuron)、(4.006) 腐絕(thiabendazole)、(4.007) 多保淨-甲酯(thiophanate-methyl)、(4.008) 座賽胺(zoxamide)、(4.009) 必噠克緹 (pyridachlometyl)、(4.010) 3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基嗒吡、(4.011)

3-氯-5-(6-氯吡啶-3-基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)嗒吡、(4.012) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.013) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.014) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.015) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.016) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.017) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.018) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.019) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.020) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.021) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.022) 4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基嗒吡、(4.023) N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.024) N-(2-溴苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.025) N-(4-氯-2,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.026) 氟醚菌醯胺(fluopimomide)。

5) 具有多位點作用之化合物，如(5.001) 波爾多混合劑(Bordeaux mixture)、(5.002) 四氯丹(captafol)、(5.003) 蓋普丹(captan)、(5.004) 四氯異苯腈(chlorothalonil)、(5.005) 氫氧化銅、(5.006) 環烷酸銅、(5.007) 氧化銅、(5.008) 氯氧化銅、(5.009) 硫酸銅(2+)、(5.010) 腈硫醯(dithianon)、(5.011) 多寧(dodine)、(5.012) 福爾培(folpet)、(5.013) 代森錳鋅(mancozeb)、(5.014) 錳乃浦(maneb)、(5.015) 免得爛(metiram)、(5.016) 免得爛鋅、(5.017) 喹啉銅(oxine-copper)、(5.018) 甲基鋅乃浦(propineb)、(5.019) 硫與硫製備物，包括多硫化鈣、(5.020) 得恩地(thiram)、(5.021) 鋅乃浦(zineb)、(5.022) 益穗(ziram)、(5.023) 6-乙基-5,7-二側氧基-6,7-二氫-5H-吡咯并[3',4':5,6][1,4]二噻吩并[2,3-c][1,2]噻唑-3-腈。

6) 能誘導宿主防禦之化合物，如(6.001) 阿拉酸式苯-S-甲酯(acibenzolar-S-methyl)、(6.002) 異噻菌胺(isotianil)、(6.003) 撲殺熱(probenazole)、

(6.004) 汰敵寧(tiadinil)。

7) 胺基酸及/或蛋白質生合成之抑制劑，如(7.001) 嘧菌環胺(cyprodinil)、(7.002) 春日黴素(kasugamycin)、(7.003) 春日黴素鹽酸鹽水合物、(7.004) 土黴素(oxytetracycline)、(7.005) 嘧黴胺(pyrimethanil)、(7.006) 3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)喹啉。

8) ATP產生之抑制劑，如(8.001) 矽硫芬(silthiofam)。

9) 細胞壁合成之抑制劑，如(9.001) 苯噻菌胺(benthiavalicarb)、(9.002) 達滅芬(dimethomorph)、(9.003) 氟嗎啉(flumorph)、(9.004) 巰黴威(iprovalicarb)、(9.005) 雙炔醯菌胺(mandipropamid)、(9.006) 丁吡嗎啉(pyrimorph)、(9.007) 霜黴滅(valifenalate)、(9.008)(2E)-3-(4-三級丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(咪啉-4-基)丙-2-烯-1-酮、(9.009)(2Z)-3-(4-三級丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(咪啉-4-基)丙-2-烯-1-酮。

10) 脂質與膜合成之抑制劑，如(10.001) 霜黴威(propamocarb)、(10.002) 霜黴威鹽酸鹽、(10.003) 脫克松(tolclofos-methyl)。

11) 黑色素生合成之抑制劑，如(11.001) 三環唑(tricyclazole)、(11.002) 托普洛卡(tolprocarb)。

12) 核酸合成之抑制劑，如(12.001) 本達樂(benalaxyl)、(12.002) 本達樂-M (開達樂(kiralaxyl))、(12.003) 滅達樂(metalaxyl)、(12.004) 滅達樂-M (右滅達樂(mefenoxam))。

13) 訊息傳遞之抑制劑，如(13.001) 護汰寧(fludioxonil)、(13.002) 依普同(iprodione)、(13.003) 撲滅寧(procymidone)、(13.004) 丙氧喹啉(proquinazid)、(13.005) 快諾芬(quinoxyfen)、(13.006) 免克寧(vinclozolin)。

14) 能作為非偶聯劑之化合物，如(14.001) 扶吉胺(fluzinam)、(14.002) 敵蟻普(meptyldinocap)。

15) 進一步之殺真菌劑，其係選自於由(15.001) 脫落酸(abscisic acid)、(15.002)

苯噻唑、(15.003) 苯噻嗪(bethoxazin)、(15.004) 卡巴西黴素、(15.005) 香芹酮(carvone)、(15.006) 螞離丹(chinomethionat)、(15.007) 硫雜靈(cufraneb)、(15.008) 環氟菌胺(cyflufenamid)、(15.009) 克絕(cymoxanil)、(15.010) 可普磺醯胺(cyprosulfamide)、(15.011) 氟替尼(flutianil)、(15.012) 福賽得-鋁(fosetyl-aluminum)、(15.013) 福賽得-鈣、(15.014) 福賽得-鈉、(15.015) 甲基異硫基氰酸酯、(15.016) 滅芬農(metrafenone)、(15.017) 米多黴素(mildiomycin)、(15.018) 納他黴素(natamycin)、(15.019) 鎳二甲基二硫基胺甲酸酯、(15.020) 異丙消(nitrothal-isopropyl)、(15.021) 歐莫克(oxamocarb)、(15.022) 奧賽普林(oxathiapiprolin)、(15.023) 奧昔芬(oxyfenthiin)、(15.024) 五氯酚與鹽類、(15.025) 亞磷酸及其鹽類、(15.026) 霜黴威-乙膦酸鹽(propamocarb-fosetilate)、(15.027) 普立芬諾(pyriofenone)(克芬酮(chlazafenone))、(15.028) 特普弗洛奎(tebufloquin)、(15.029) 克枯爛(tecloftalam)、(15.030) 甲磺菌胺(tolnifanide)、(15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(15.033) 2-(6-苄基吡啶-2-基)喹唑啉、(15.034) 二吡美酮(dipymetitrone)、(15.035) 2-[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.036) 2-[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.037) 2-[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.038) 2-[6-(3-氟-4-甲氧基苯基)-5-甲基吡啶-2-基]喹唑啉、(15.039) 2-[(5R)-3-[2-(1-{[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-5-基]-3-氯苯基甲磺酸酯、(15.040) 2-[(5S)-3-[2-(1-{[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基}哌

啉-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-5-基}-3-氯苯基甲烷磺酸酯、(15.041) 伊氟吩萘琴(ipflufenquin)、(15.042) 2-{2-氟-6-[(8-氟-2-甲基喹啉-3-基)氧基]苯基}丙-2-醇、(15.043) fluoxapiprolin、(15.044) 2-{3-[2-(1-{[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-5-基}苯基甲烷磺酸酯、(15.045) 2-苯基酚與鹽類、(15.046) 3-(4,4,5-三氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)喹啉、(15.047) quinofumelin、(15.048) 4-胺基-5-氟嘧啶-2-醇(互變異構物形式：4-胺基-5-氟嘧啶-2(1H)-酮)、(15.049) 4-側氧基-4-[(2-苯基乙基)胺基]丁酸、(15.050) 5-胺基-1,3,4-噻二唑-2-硫基、(15.051) 5-氯-N'-苯基-N'-(丙-2-炔-1-基)噻吩-2-磺醯肼、(15.052) 5-氟-2-[(4-氟苄基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.053) 5-氟-2-[(4-甲基苄基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.054) 9-氟-2,2-二甲基-5-(喹啉-3-基)-2,3-二氫-1,4-苯并氧氮雜、(15.055) 丁-3-炔-1-基 {6-[(1-(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亞甲基)胺基}氧基)甲基]吡啶-2-基}胺甲酸酯、(15.056)(2Z)-3-胺基-2-氰基-3-苯基丙烯酸乙酯、(15.057) 啡咾-1-羧酸、(15.058) 3,4,5-三羥基苯甲酸丙酯、(15.059) 喹啉-8-醇、(15.060) 喹啉-8-醇硫酸酯(2:1)、(15.061) 三級丁基{6-[(1-(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亞甲基)胺基}氧基)甲基]吡啶-2-基}胺甲酸酯、(15.062) 5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-[(4-甲基苄基)磺醯基]-3,4-二氫嘧啶-2(1H)-酮、(15.063) 胺基比芬、(15.064)(N'-[2-氯-4-(2-氟苯氧基)-5-甲基苄基]-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺)、(15.065)(N'-(2-氯-5-甲基-4-苯氧基苄基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺)、(15.066)(2-{2-[(7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基)氧基]-6-氟苄基}丙-2-醇)、(15.067)(5-溴-1-(5,6-二甲基吡啶-3-基)-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉)、(15.068)(3-(4,4-二氟-5,5-二甲基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]吡啶-7-基)喹啉)、(15.069)(1-(4,5-二甲基-1H-苯并咪唑-1-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉)、(15.070) 8-氟-3-(5-氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)喹啉酮、(15.071) 8-氟-3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)喹啉酮、(15.072) 3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)-8-氟喹啉、(15.073)(N-甲基-N-苯基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯甲醯

胺)、(15.074) 甲基 {4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基}胺甲酸酯、
 (15.075)(N-{4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苄基}環丙烷羧醯胺)、(15.076)
 N-甲基-4-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基)苯甲醯胺、(15.077) N-[(E)-甲氧基亞
 胺基甲基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯甲醯胺、(15.078) N-[(Z)-甲氧
 基亞胺基甲基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯甲醯胺、(15.079)
 N-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基]環丙烷羧醯胺、(15.080) N-(2-氟苯
 基)-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯甲醯胺、(15.081) 2,2-二氟-N-甲基
 -2-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基]乙醯胺、(15.082) N-烯丙基
 -N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基]甲基]乙醯胺、(15.083) N-[(E)-N-
 甲氧基-C-甲基-碳亞胺基]-4-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基)苯甲醯胺、
 (15.084) N-[(Z)-N-甲氧基-C-甲基-碳亞胺基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-
 基]苯甲醯胺、(15.085) N-烯丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯
 基]甲基]丙醯胺、(15.086) 4,4-二甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯
 基]甲基]吡咯啉2-酮、(15.087) N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯碳
 硫醯胺、(15.088) 5-甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基]甲基]吡咯
 啉2-酮、(15.089) N-((2,3-二氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基)甲
 基)-3,3,3-三氟-丙醯胺、(15.090) 1-甲氧基-1-甲基-3-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二
 氮唑-3-基]苯基]甲基]脲、(15.091) 1,1-二ethyl-3-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑
 -3-基]苯基]甲基]脲、(15.092) N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基]甲
 基]丙醯胺、(15.093) N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基]甲
 基]環丙烷羧醯胺、(15.094) 1-甲氧基-3-甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑
 -3-基]苯基]甲基]脲、(15.095) N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]
 苯基]甲基]環丙烷羧醯胺、(15.096) N,2-二甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二
 氮唑-3-基]苯基]甲基]丙醯胺、(15.097) N-乙基-2-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-
 噁二氮唑-3-基]苯基]甲基]丙醯胺、(15.098) 1-甲氧基-3-甲基-1-[[4-[5-(三氟甲

基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基]甲基]脲、(15.099) 1,3-二甲氧基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基]甲基]脲、(15.100) 3-乙基-1-甲氧基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基]甲基]脲、(15.101) 1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基]甲基]哌啶-2-酮、(15.102) 4,4-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基]甲基]異噁唑啉-3-酮、(15.103) 5,5-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基]甲基]異噁唑啉-3-酮、(15.104) 3,3-二甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基]甲基]哌啶-2-酮、(15.105) 1-[[3-氟-4-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基]甲基]氮呋-2-酮、(15.106) 4,4-二甲基-2-[[4-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基]甲基]異噁唑啉-3-酮、(15.107) 5,5-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基]甲基]異噁唑啉-3-酮、(15.108) 1-{4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苄基}-1H-吡唑-4-羧酸乙酯、(15.109) N,N-二甲基-1-{4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苄基}-1H-1,2,4-三唑-3-胺、(15.110) N-{2,3-二氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苄基}丁醯胺、(15.111) N-(1-甲基環丙基)-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苄甲醯胺、(15.112) N-(2,4-二氟苯基)-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苄甲醯胺、(15.113) 1-(5,6-二甲基吡啶-3-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉、(15.114) 1-(6-(二氟甲基)-5-甲基-吡啶-3-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉、(15.115) 1-(5-(氟甲基)-6-甲基-吡啶-3-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉、(15.116) 1-(6-(二氟甲基)-5-甲氧基-吡啶-3-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉、(15.117) 4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基 二甲基胺甲酸酯、(15.118) N-{4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二氮唑-3-基]苯基}丙醯胺、(15.119) 3-[2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-1,5-二氫-2,4-苯并二氧雜環庚烯-6-基甲烷磺酸酯、(15.120) 9-氟-3-[2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-1,5-二氫-2,4-苯并二氧雜環庚烯-6-基甲烷磺酸酯、(15.121) 3-[2-(1-{[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基}]

哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-1,5-二氫-2,4-苯并二氧雜環庚烯-6-基甲烷磺酸酯、(15.122) 3-[2-(1-{[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-9-氟-1,5-二氫-2,4-苯并二氧雜環庚烯-6-基甲烷磺酸酯、(15.123) 1-(6,7-二甲基吡唑啉[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉、(15.124) 8-氟-N-(4,4,4-三氟-2-甲基-1-苯基丁-2-基)喹啉-3-羧醯胺、(15.125) 8-氟-N-[(2S)-4,4,4-三氟-2-甲基-1-苯基丁-2-基]喹啉-3-羧醯胺、(15.126) N-(2,4-二甲基-1-苯基戊-2-基)-8-氟喹啉-3-羧醯胺、及(15.127) N-[(2S)-2,4-二甲基-1-苯基戊-2-基]-8-氟喹啉-3-羧醯胺組成之群組。

【0117】類別(1)至(15)之所有命名的混合參與物，若其官能基允許，可任意地以適用之鹼與酸形成鹽類。

【0118】本發明之另一態樣係有關下列化合物組合之一或多者：

(I.01) + (1.001)、(I.01) + (1.002)、(I.01) + (1.003)、(I.01) + (1.004)、(I.01) + (1.005)、(I.01) + (1.006)、(I.01) + (1.007)、(I.01) + (1.008)、(I.01) + (1.009)、(I.01) + (1.010)、(I.01) + (1.011)、(I.01) + (1.012)、(I.01) + (1.013)、(I.01) + (1.014)、(I.01) + (1.015)、(I.01) + (1.016)、(I.01) + (1.017)、(I.01) + (1.018)、(I.01) + (1.019)、(I.01) + (1.020)、(I.01) + (1.021)、(I.01) + (1.022)、(I.01) + (1.023)、(I.01) + (1.024)、(I.01) + (1.025)、(I.01) + (1.026)、(I.01) + (1.027)、(I.01) + (1.028)、(I.01) + (1.029)、(I.01) + (1.030)、(I.01) + (1.031)、(I.01) + (1.032)、(I.01) + (1.033)、(I.01) + (1.034)、(I.01) + (1.035)、(I.01) + (1.036)、(I.01) + (1.037)、(I.01) + (1.038)、(I.01) + (1.039)、(I.01) + (1.040)、(I.01) + (1.041)、(I.01) + (1.042)、(I.01) + (1.043)、(I.01) + (1.044)、(I.01) + (1.045)、(I.01) + (1.046)、(I.01) + (1.047)、(I.01) + (1.048)、(I.01) + (1.049)、(I.01) + (1.050)、(I.01) + (1.051)、(I.01) + (1.052)、(I.01) + (1.053)、(I.01) + (1.054)、(I.01) + (1.055)、(I.01) + (1.056)、(I.01) + (1.057)、(I.01) + (1.058)、(I.01) + (1.059)、(I.01) + (1.060)、(I.01) + (1.061)、(I.01) + (1.062)、(I.01) + (1.063)、(I.01) + (1.064)、(I.01) + (1.065)、(I.01) + (1.066)、(I.01) + (1.067)、(I.01) + (1.068)、(I.01) + (1.069)、(I.01)

+ (1.070) 、(I.01) + (1.071) 、(I.01) + (1.072) 、(I.01) + (1.073) 、(I.01) + (1.074) 、(I.01)
+ (1.075) 、(I.01) + (1.076) 、(I.01) + (1.077) 、(I.01) + (1.078) 、(I.01) + (1.079) 、(I.01)
+ (1.080) 、(I.01) + (1.081) 、(I.01) + (1.082) 、(I.01) + (1.083) 、(I.01) + (1.084) 、(I.01)
+ (1.085) 、(I.01) + (1.086) 、(I.01) + (1.087) 、(I.01) + (1.088) 、(I.01) + (1.089) 、(I.01)
+ (2.001) 、(I.01) + (2.002) 、(I.01) + (2.003) 、(I.01) + (2.004) 、(I.01) + (2.005) 、(I.01)
+ (2.006) 、(I.01) + (2.007) 、(I.01) + (2.008) 、(I.01) + (2.009) 、(I.01) + (2.010) 、(I.01)
+ (2.011) 、(I.01) + (2.012) 、(I.01) + (2.013) 、(I.01) + (2.014) 、(I.01) + (2.015) 、(I.01)
+ (2.016) 、(I.01) + (2.017) 、(I.01) + (2.018) 、(I.01) + (2.019) 、(I.01) + (2.020) 、(I.01)
+ (2.021) 、(I.01) + (2.022) 、(I.01) + (2.023) 、(I.01) + (2.024) 、(I.01) + (2.025) 、(I.01)
+ (2.026) 、(I.01) + (2.027) 、(I.01) + (2.028) 、(I.01) + (2.029) 、(I.01) + (2.030) 、(I.01)
+ (2.031) 、(I.01) + (2.032) 、(I.01) + (2.033) 、(I.01) + (2.034) 、(I.01) + (2.035) 、(I.01)
+ (2.036) 、(I.01) + (2.037) 、(I.01) + (2.038) 、(I.01) + (2.039) 、(I.01) + (2.040) 、(I.01)
+ (2.041) 、(I.01) + (2.042) 、(I.01) + (2.043) 、(I.01) + (2.044) 、(I.01) + (2.045) 、(I.01)
+ (2.046) 、(I.01) + (2.047) 、(I.01) + (2.048) 、(I.01) + (2.049) 、(I.01) + (2.050) 、(I.01)
+ (2.051) 、(I.01) + (2.052) 、(I.01) + (2.053) 、(I.01) + (2.054) 、(I.01) + (2.055) 、(I.01)
+ (2.056) 、(I.01) + (2.057) 、(I.01) + (2.058) 、(I.01) + (2.059) 、(I.01) + (2.060) 、(I.01)
+ (3.001) 、(I.01) + (3.002) 、(I.01) + (3.003) 、(I.01) + (3.004) 、(I.01) + (3.005) 、(I.01)
+ (3.006) 、(I.01) + (3.007) 、(I.01) + (3.008) 、(I.01) + (3.009) 、(I.01) + (3.010) 、(I.01)
+ (3.011) 、(I.01) + (3.012) 、(I.01) + (3.013) 、(I.01) + (3.014) 、(I.01) + (3.015) 、(I.01)
+ (3.016) 、(I.01) + (3.017) 、(I.01) + (3.018) 、(I.01) + (3.019) 、(I.01) + (3.020) 、(I.01)
+ (3.021) 、(I.01) + (3.022) 、(I.01) + (3.023) 、(I.01) + (3.024) 、(I.01) + (3.025) 、(I.01)
+ (3.026) 、(I.01) + (3.027) 、(I.01) + (3.028) 、(I.01) + (3.029) 、(I.01) + (3.030) 、(I.01)
+ (3.031) 、(I.01) + (4.001) 、(I.01) + (4.002) 、(I.01) + (4.003) 、(I.01) + (4.004) 、(I.01)
+ (4.005) 、(I.01) + (4.006) 、(I.01) + (4.007) 、(I.01) + (4.008) 、(I.01) + (4.009) 、(I.01)
+ (4.010) 、(I.01) + (4.011) 、(I.01) + (4.012) 、(I.01) + (4.013) 、(I.01) + (4.014) 、(I.01)

+ (4.015) 、(I.01) + (4.016) 、(I.01) + (4.017) 、(I.01) + (4.018) 、(I.01) + (4.019) 、(I.01)
+ (4.020) 、(I.01) + (4.021) 、(I.01) + (4.022) 、(I.01) + (4.023) 、(I.01) + (4.024) 、(I.01)
+ (4.025) 、(I.01) + (4.026) 、(I.01) + (5.001) 、(I.01) + (5.002) 、(I.01) + (5.003) 、(I.01)
+ (5.004) 、(I.01) + (5.005) 、(I.01) + (5.006) 、(I.01) + (5.007) 、(I.01) + (5.008) 、(I.01)
+ (5.009) 、(I.01) + (5.010) 、(I.01) + (5.011) 、(I.01) + (5.012) 、(I.01) + (5.013) 、(I.01)
+ (5.014) 、(I.01) + (5.015) 、(I.01) + (5.016) 、(I.01) + (5.017) 、(I.01) + (5.018) 、(I.01)
+ (5.019) 、(I.01) + (5.020) 、(I.01) + (5.021) 、(I.01) + (5.022) 、(I.01) + (5.023) 、(I.01)
+ (6.001) 、(I.01) + (6.002) 、(I.01) + (6.003) 、(I.01) + (6.004) 、(I.01) + (7.001) 、(I.01)
+ (7.002) 、(I.01) + (7.003) 、(I.01) + (7.004) 、(I.01) + (7.005) 、(I.01) + (7.006) 、(I.01)
+ (8.001) 、(I.01) + (9.001) 、(I.01) + (9.002) 、(I.01) + (9.003) 、(I.01) + (9.004) 、(I.01)
+ (9.005) 、(I.01) + (9.006) 、(I.01) + (9.007) 、(I.01) + (9.008) 、(I.01) + (9.009) 、(I.01)
+ (10.001) 、(I.01) + (10.002) 、(I.01) + (10.003) 、(I.01) + (11.001) 、(I.01) + (11.002) 、
(I.01) + (12.001) 、(I.01) + (12.002) 、(I.01) + (12.003) 、(I.01) + (12.004) 、(I.01) +
(13.001) 、(I.01) + (13.002) 、(I.01) + (13.003) 、(I.01) + (13.004) 、(I.01) + (13.005) 、
(I.01) + (13.006) 、(I.01) + (14.001) 、(I.01) + (14.002) 、(I.01) + (15.001) 、(I.01) +
(15.002) 、(I.01) + (15.003) 、(I.01) + (15.004) 、(I.01) + (15.005) 、(I.01) + (15.006) 、
(I.01) + (15.007) 、(I.01) + (15.008) 、(I.01) + (15.009) 、(I.01) + (15.010) 、(I.01) +
(15.011) 、(I.01) + (15.012) 、(I.01) + (15.013) 、(I.01) + (15.014) 、(I.01) + (15.015) 、
(I.01) + (15.016) 、(I.01) + (15.017) 、(I.01) + (15.018) 、(I.01) + (15.019) 、(I.01) +
(15.020) 、(I.01) + (15.021) 、(I.01) + (15.022) 、(I.01) + (15.023) 、(I.01) + (15.024) 、
(I.01) + (15.025) 、(I.01) + (15.026) 、(I.01) + (15.027) 、(I.01) + (15.028) 、(I.01) +
(15.029) 、(I.01) + (15.030) 、(I.01) + (15.031) 、(I.01) + (15.032) 、(I.01) + (15.033) 、
(I.01) + (15.034) 、(I.01) + (15.035) 、(I.01) + (15.036) 、(I.01) + (15.037) 、(I.01) +
(15.038) 、(I.01) + (15.039) 、(I.01) + (15.040) 、(I.01) + (15.041) 、(I.01) + (15.042) 、
(I.01) + (15.043) 、(I.01) + (15.044) 、(I.01) + (15.045) 、(I.01) + (15.046) 、(I.01) +

(15.047)、(I.01)+(15.048)、(I.01)+(15.049)、(I.01)+(15.050)、(I.01)+(15.051)、
 (I.01)+(15.052)、(I.01)+(15.053)、(I.01)+(15.054)、(I.01)+(15.055)、(I.01)+
 (15.056)、(I.01)+(15.057)、(I.01)+(15.058)、(I.01)+(15.059)、(I.01)+(15.060)、
 (I.01)+(15.061)、(I.01)+(15.062)、(I.01)+(15.063)、(I.01)+(15.064)、(I.01)+
 (15.065)、(I.01)+15.066)、(I.01)+(15.067)、(I.01)+(15.068)、(I.01)+(15.069)、
 (I.01)+(15.070)、(I.01)+(15.071)、(I.01)+(15.072)、(I.01)+(15.073)、(I.01)+
 (15.074)、(I.01)+(15.075)、(I.01)+(15.076)、(I.01)、(I.01)+(15.077)、(I.01)+
 (15.078)、(I.01)+(15.079)、(I.01)+(15.080)、(I.01)+(15.081)、(I.01)+(15.082)、
 (I.01)+(15.083)、(I.01)+(15.084)、(I.01)+(15.085)、(I.01)+(15.086)、(I.01)+
 (15.087)、(I.01)+(15.088)、(I.01)+(15.089)、(I.01)+(15.090)、(I.01)+(15.091)、
 (I.01)+(15.092)、(I.01)+(15.093)、(I.01)+(15.094)、(I.01)+(15.095)、(I.01)+
 (15.096)、(I.01)+(15.097)、(I.01)+(15.098)、(I.01)+(15.099)、(I.01)+(15.100)、
 (I.01)+(15.101)、(I.01)+(15.102)、(I.01)+(15.103)、(I.01)+(15.104)、(I.01)+
 (15.105)、(I.01)+(15.106)、(I.01)+(15.107)、(I.01)+(15.108)、(I.01)+(15.109)、
 (I.01)+(15.110)、(I.01)+(15.111)、(I.01)+(15.112)、(I.01)+(15.113)、(I.01)+
 (15.114)、(I.01)+(15.115)、(I.01)+(15.116)、(I.01)+(15.117)、(I.01)+(15.118)、
 (I.01)+(15.119)、(I.01)+(15.120)、(I.01)+(15.121)、(I.01)+(15.122)、(I.01)+
 (15.123)、(I.01)+(15.124)、(I.01)+(15.125)、(I.01)+(15.126)、(I.01)+(15.127)。

【0119】 在彼等組合中，第一個組分為如表1所定義之式(I)化合物(如 I.01)，且第二個組分為選自於如本文所定義之群組1至15之殺真菌劑。舉例而言，組合(I.01)+(1.001)相當於含有表1之化合物I.01與環克座(1.001)之組合。

【0120】 在一些其他具體實施例中，化合物組合相當於上述之組合，其中化合物(I.01)係以表1引用之化合物之任一者替代。

【0121】 式(I)化合物與選自於群組(1)至(15)之殺真菌劑之重量比率範圍可為100:1至1:100 (式(I)化合物：選自於群組(1)至(15)之殺真菌劑)，或範圍可為50:1

至1:50，或範圍可為20:1至1:20。重量比率範圍之進一步實例包括95:1至1:95、90:1至1:90、85:1至1:85、80:1至1:80、75:1至1:75、70:1至1:70、65:1至1:65、60:1至1:60、55:1至1:55、45:1至1:45、40:1至1:40、35:1至1:35、30:1至1:30、25:1至1:25、15:1至1:15、10:1至1:10、5:1至1:5、4:1至1:4、3:1至1:3、2:1至1:2。

【0122】可將一選自於如本文所定義之群組1至15之進一步殺真菌劑添加至化合物組合中。

【0123】式(I)化合物及包含其之組成物可組合一或多個生物防治劑。

【0124】可與式(I)化合物及包含其之組成物結合之生物防治劑的實施例為：

(A) 選自於下列群組之抗菌劑：

(A1) 細菌，如(A1.1) 枯草桿菌(*Bacillus subtilis*)，特別是菌株QST713/AQ713 (購自Bayer CropScience LP, US之SERENADE OPTI或SERENADE ASO，其具有NRRL登錄號B21661，且描述於美國專利號6,060,051)；(A1.2) 芽孢枯草桿菌(*Bacillus amyloliquefaciens*)，特別是菌株D747 (購自之Double Nickel™ from Certis, US，其具有登錄號FERM BP-8234，且描述於美國專利號7,094,592)；(A1.3) 短小芽孢桿菌(*Bacillus pumilus*)，特別是菌株BU F-33 (具有NRRL登錄號50185)；(A1.4) 枯草桿菌變種芽孢枯草桿菌菌株FZB24 (購自Novozymes, US之Taegro®)；(A1.5) 芽孢桿菌屬(*Paenibacillus sp.*)菌株，其具有登錄號NRRL B-50972或登錄號NRRL B-67129，且描述於國際專利公開號WO 2016/154297；以及

(A2) 真菌，如(A2.1) 暗金黃擔子菌(*Aureobasidium pullulans*)，特別是菌株DSM14940之芽生孢子；(A2.2) 暗金黃擔子菌菌株DSM 14941之芽生孢子；(A2.3) 暗金黃擔子菌，特別是菌株DSM14940與DSM14941之芽生孢子之混合物；

(B) 選自於下列群組之殺真菌劑：

(B1) 細菌，如(B1.1) 枯草桿菌，特別是菌株QST713/AQ713 (購自Bayer CropScience LP, US之SERENADE OPTI或SERENADE ASO，其具有NRRL登錄

號B21661，且描述於美國專利號6,060,051)；(B1.2) 短小芽胞桿菌，特別是菌株QST2808 (購自Bayer CropScience LP, US之SONATA[®]，其具有登錄號NRRL B-30087，且描述於美國專利號6,245,551)；(B1.3) 短小芽胞桿菌，特別是菌株GB34 (購自Bayer AG, DE之Yield Shield[®])；(B1.4) 短小芽胞桿菌，特別是菌株BUF-33 (具有NRRL登錄號50185)；(B1.5) 芽孢枯草桿菌，特別是菌株D747 (購自Certis, US之Double Nickel[™]，其具有登錄號FERM BP-8234，且描述於美國專利號7,094,592)；(B1.6) 枯草桿菌Y1336 (購自Bion-Tech, Taiwan之BIOBAC[®] WP，其在台灣註冊為生物殺真菌劑，其註冊號為4764、5454、5096、及5277)；(B1.7) 芽孢枯草桿菌菌株MBI 600 (購自BASF SE之SUBTILEX)；(B1.8) 枯草桿菌菌株GB03 (購自Bayer AG, DE之Kodiak[®])；(B1.9) 枯草桿菌變種芽孢枯草桿菌菌株FZB24 (購自Novozymes Biologicals Inc., Salem, Virginia 或 Syngenta Crop Protection, LLC, Greensboro, North Carolina之殺真菌劑TAEGRO[®]或TAEGRO[®] ECO (EPA註冊號70127-5)；(B1.10) 蕈狀桿菌(*Bacillus mycoides*)，分離株J (購自Certis USA之BmJ TGA1或WG)；(B1.11) 地衣芽孢桿菌(*Bacillus licheniformis*)，特別是菌株SB3086 (購自Novozymes之EcoGuard TM Biofungicide與Green Releaf)；(B1.12) 芽孢桿菌屬菌株，其具有登錄號NRRL B-50972或登錄號NRRL B-67129，且描述於國際專利公開號WO 2016/154297。

【0125】 在一些具體實施例中，生物防治劑為枯草桿菌或芽孢枯草桿菌菌株，其產生豐原素(fengycin)類或披巴斯他汀(plipastatin)類化合物、伊枯草菌素(iturin)類化合物、及/或表面素(surfactin)類化合物。有關背景資料，請參閱以下評論文章：Ongena, M., et al., “*Bacillus* Lipopeptides: Versatile Weapons for Plant 病害 Biocontrol,” Trends in Microbiology, Vol 16, No. 3, March 2008, pp. 115-125。芽孢桿菌菌株能產生脂肽，包括枯草桿菌QST713 (購自Bayer CropScience LP, US之SERENADE OPTI或SERENADE ASO，其具有NRRL登錄號B21661，且描述於美國專利號6,060,051)；芽孢枯草桿菌菌株D747 (購自Certis, US之Double

Nickel™，其具有登錄號FERM BP-8234，且描述於美國專利號7,094,592)；枯草桿菌MBI600 (購自Becker Underwood, US之SUBTILEX®，EPA註冊號71840-8)；枯草桿菌Y1336 (購自Bion-Tech, Taiwan之BIOBAC® WP，其在台灣註冊為生物殺真菌劑，其註冊號為4764、5454、5096、及5277)；芽孢枯草桿菌，特別是菌株FZB42 (購自ABiTEP, DE之RHIZOVITAL®)；以及枯草桿菌變種芽孢枯草桿菌FZB24 (購自Novozymes Biologicals Inc., Salem, Virginia 或 Syngenta Crop Protection, LLC, Greensboro, North Carolina之殺真菌劑TAEGRO®或TAEGRO® ECO (EPA註冊號70127-5)；以及

(B2) 真菌，如：(B2.1) 微坦盾殼黴菌(*Coniothyrium minitans*)，特別是菌株CON/M/91-8 (登錄號DSM-9660；如購自Bayer之Contans®)；(B2.2) 核果梅奇酵母菌(*Metschnikowia fructicola*)，特別是菌株NRRL Y-30752 (如Shemer®)；(B2.3) 小球殼孢菌(*Microsphaeropsis ochracea*)(如購自Prophyta之Microx®)；(B2.5) 木黴菌屬(*Trichoderma spp.*)，包括深綠木黴菌(*Trichoderma atroviride*)，菌株SC1，描述於國際專利申請號PCT/IT2008/000196)；(B2.6) 哈茨木黴菌(哈茨木黴菌 *rifai*)菌株KRL-AG2 (亦稱作菌株T-22，/ATCC 208479，如購自BioWorks, US之PLANTSHIELD T-22G，Rootshield®與TurfShield)；(B2.14) 粉紅黏帚黴菌(*Gliocladium roseum*)，菌株321U，購自W.F. Stoneman Company LLC；(B2.35) 黃藍狀菌(*Talaromyces flavus*)，菌株V117b；(B2.36) 棘孢木黴菌(*Trichoderma asperellum*)，菌株ICC 012，購自Isagro；(B2.37) 棘孢木黴菌，菌株SKT-1 (如購自Kumiai Chemical Industry之ECO-HOPE®)；(B2.38) 深綠木黴菌，菌株CNCM I-1237 (如購自Agrauxine, FR之Esquive® WP)；(B2.39) 深綠木黴菌，菌株編號V08/002387；(B2.40) 深綠木黴菌，菌株NMI 編號V08/002388；(B2.41) 深綠木黴菌，菌株NMI編號V08/002389；(B2.42) 深綠木黴菌，菌株NMI編號V08/002390；(B2.43) 深綠木黴菌，菌株LC52 (如購自Agrimm Technologies Limited之Tenet)；(B2.44) 深綠木黴菌，菌株ATCC 20476 (IMI 206040)；(B2.45) 深綠木黴菌，菌株

T11 (IMI352941/ CECT20498) ; (B2.46) 鉤狀木黴菌(*Trichoderma harmatum*) ; (B2.47) 哈茨木黴菌 ; (B2.48) 哈茨木黴菌 T39 (如購自 Makhteshim, US 之 Trichodex[®]) ; (B2.49) 哈茨木黴菌，特別是，菌株KD (如購自 Biological Control Products, SA (由Becker Underwood併購)之Trichoplus) ; (B2.50) 哈茨木黴菌，菌株ITEM 908 (如購自 Koppert之Trianum-P) ; (B2.51) 哈茨木黴菌，菌株TH35 (如購自 Mycontrol之Root-Pro) ; (B2.52) 綠木黴菌(*Trichoderma virens*)(亦稱作黏帚黴菌(*Gliocladium virens*))，特別是菌株GL-21 (如購自 Certis, US之SoilGard 12G) ; (B2.53) 綠木黴菌(*Trichoderma viride*)，菌株TV1(如購自 Koppert之Trianum-P) ; (B2.54) 白粉寄生菌(*Ampelomyces quisqualis*)，特別是菌株AQ 10 (如購自 IntrachemBio, Italia之AQ 10[®]) ; (B2.56) 暗金黃擔子菌，特別是菌株DSM14940之芽生孢子 ; (B2.57) 暗金黃擔子菌，特別是菌株DSM 14941之芽生孢子 ; (B2.58) 暗金黃擔子菌，特別是菌株DSM14940與菌株DSM 14941之芽生孢子的混合物(如購自 bio-ferm, CH之Botector[®]) ; (B2.64) 芽枝狀枝孢(*Cladosporium cladosporioides*)，菌株H39 (購自 Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoek) ; (B2.69) 鏈孢黏帚黴菌(*Gliocladium catenulatum*)(同義詞：*Clonostachys rosea f. catenulate*)菌株J1446 (如購自 AgBio Inc.之Prestop[®]及購自 Kemira Agro Oy之Primastop[®]) ; (B2.70) 錯階輪枝菌(*Lecanicillium lecanii*)(原名為*Verticillium lecanii*)菌株KV01之分生孢子(如購自 Koppert/Arysta之Vertalec[®]) ; (B2.71) 蠕形青黴菌(*Penicillium vermiculatum*) ; (B2.72) 異常畢赤酵母菌(*Pichia anomala*)，菌株WRL-076 (NRRL Y-30842) ; (B2.75) 深綠木黴菌，菌株SKT-1 (FERM P-16510) ; (B2.76) 深綠木黴菌，菌株SKT-2 (FERM P-16511) ; (B2.77) 深綠木黴菌，菌株SKT-3 (FERM P-17021) ; (B2.78) 蓋棘木黴菌(*Trichoderma gamsii*)(原名為*T. viride*)，菌株ICC080 (IMI CC 392151 CABI，如購自 AGROBIOSOL DE MEXICO, S.A. DE C.V.之BioDerma) ; (B2.79) 哈茨木黴菌，菌株DB 103，如購自 Dagutat Biolab之T-Gro 7456) ; (B2.80) 多孢木黴菌(*Trichoderma polysporum*)，菌株IMI 206039 (如購自 BINAB

Bio-Innovation AB, Sweden之Binab TF WP)；(B2.81) 子座木黴菌(*Trichoderma stromaticum*)(如購自 Ceplac, Brazil 之 Tricovab)；(B2.83) 奧德曼細基格孢(*Ulocladium oudemansii*)，特別是菌株 HRU3 (如購自 Botry-Zen Ltd, NZ 之 Botry-Zen[®])；(B2.84) 黑白輪枝菌(*Verticillium albo-atrum*)(原名為大麗輪枝菌(*V. dahliae*))，菌株 WCS850 (CBS 276.92；如購自 Tree Care Innovations 之 Dutch Trig)；(B2.86) 厚壁輪枝菌(*Verticillium chlamydosporium*)；(B2.87) 棘孢木黴菌菌株 ICC 012 與蓋棘木黴菌菌株 ICC 080 之混合物(產品為如購自 Bayer CropScience LP, US 之 BIO-TAM[™])。

【0126】可與式(I)化合物及包含其之組成物組合之生物防治劑的進一步實例為：

選自於由臘狀桿菌(*Bacillus cereus*)，特別是臘狀桿菌菌株 CNCM I-1562 與堅強芽孢桿菌(*Bacillus firmus*)，菌株 I-1582 (登錄號 CNCM I-1582)、枯草桿菌菌株 OST 30002 (登錄號 NRRL B-50421)、蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)，特別是蘇力菌以色列亞種(血清型 H-14)，菌株 AM65-52 (登錄號 ATCC 1276)、蘇力菌鮎澤亞種，特別是菌株 ABTS-1857 (SD-1372)、蘇力菌庫斯亞種菌株 HD-1，蘇力菌擬步行蟲亞種菌株 NB 176 (SD-5428)、穿透巴斯德芽孢菌(*Pasteuria penetrans*)、巴斯德菌屬(*Pasteuria spp.*)(腎形線蟲(*Rotylenchulus reniformis*))-PR3 (登錄號 ATCC SD-5834)、細黃鏈黴菌(*Streptomyces microflavus*)菌株 AQ6121 (= QRD 31.013，NRRL B-50550)、及鮮黃鏈黴菌(*Streptomyces galbus*)菌株 AQ 6047 (登錄號 NRRL 30232)所組成族群之細菌；

選自於由白殭菌(*Beauveria bassiana*)，特別是菌株 ATCC 74040，輪枝菌屬(*Lecanicillium spp.*)，特別是菌株 HRO LEC 12、黑殭菌(*Metarhizium anisopliae*)，特別是菌株 F52 (DSM3884 或 ATCC 90448)、玫煙色擬青黴菌(*Paecilomyces fumosoroseus*)(現名：玫煙色棒束孢菌(*Isaria fumosorosea*))，特別是菌株 IFPC 200613，或菌株 Apopka 97 (登錄號 ATCC 20874)、及淡紫擬青黴菌(*Paecilomyces*

lilacinus)，特別是淡紫擬青黴菌菌株251 (AGAL 89/030550)所組成族群之真菌與酵母菌；

選自於由棉褐帶捲葉蛾(*Adoxophyes orana*)(夏季水果捲葉蛾)顆粒病毒(GV)、蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella*)(codling moth)顆粒病毒(GV)、番茄夜蛾(*Helicoverpa armigera*)(番茄夜蛾)核多角體病毒(NPV)、甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua*)(甜菜夜蛾) mNPV、草地夜蛾(*Spodoptera frugiperda*)(秋季夜蛾) mNPV、及海灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis*)(非洲棉葉蟲) NPV所組成族群之病毒。

亦包括作為「接種劑」添加至植物或植物部位或植物器官中之細菌與真菌，且所述之細菌與真菌藉由其特定性質促進植物生長與植物健康。實施例為：土壤桿菌屬(*Agrobacterium spp.*)、固氮根瘤菌 (*Azorhizobium caulinodans*)、固氮螺旋菌屬(*Azospirillum spp.*)、固氮菌屬(*Azotobacter spp.*)、慢生根瘤菌屬(*Bradyrhizobium spp.*)、伯克氏菌屬(*Burkholderia spp.*)，特別是洋蔥伯克氏菌(*Burkholderia cepacia*)(原名為洋蔥假單胞菌(*Pseudomonas cepacia*))、巨孢囊黴菌屬(*Gigaspora spp.*)、或單胞巨孢囊黴菌(*Gigaspora monosporum*)、球囊黴菌屬(*Glomus spp.*)、錯磨菌屬(*Laccaria spp.*)、布氏乳桿菌(*Lactobacillus buchneri*)、類球囊黴菌屬(*Paraglomus spp.*)、彩色豆馬勃菌(*Pisolithus tinctorus*)、假單胞菌屬(*Pseudomonas spp.*)、根瘤菌屬(*Rhizobium spp.*)，特別是三葉草根瘤菌(*Rhizobium trifolii*)、須腹菌屬(*Rhizopogon spp.*)、硬皮馬勃菌屬(*Scleroderma spp.*)、乳牛桿菌屬(*Suillus spp.*)、及鏈黴菌屬(*Streptomyces spp.*)。

由微生物形成之植物萃取物與產物，包括蛋白質與二次代謝物，其可用作生物防治劑，如大蒜(*Allium sativum*)、苦艾(*Artemisia absinthium*)、印苦楝子素(azadirachtin)、Biokeeper WP、黑肉桂(*Cassia nigricans*)、苦皮藤(*Celastrus angulatus*)、美洲土荊芥(*Chenopodium anthelminticum*)、幾丁質、Armour-Zen、綿馬(*Dryopteris filix-mas*)、馬尾草(*Equisetum arvense*)、Fortune Aza、Fungastop、Heads Up (藜麥(*Chenopodium quinoa*)皂苷萃取物)、除蟲菊/除蟲菊素

(*Pyrethrum/Pyrethrins*)、蘇利南苦樹(*Quassia amara*)、櫟(*Quercus*)、阜樹(*Quillaja*)、(Regalia)、「Requiem™殺蟲劑」、魚藤酮(rotenone)、魚尼丁/蘭諾定(*ryania/ryanodine*)、西門肺草(*Symphytum officinale*)、艾菊(*Tanacetum vulgare*)、麝香草酸(thymol)、Triact 70、TriCon、大金蓮花(*Tropaeolum majus*)、大蓴麻(*Urtica dioica*)、藜蘆定(Veratrin)、桑寄生(*Viscum album*)、十字花科(*Brassicaceae*)萃取物，特別是油菜籽粉或芥末粉。

【0127】可與式(I)化合物及包含其之組成物混合之殺蟲劑、殺蟎劑、及殺線蟲劑的實施例分別為：

(1) 乙醯膽鹼酯酶(AChE)抑制劑，如胺甲酸酯類，如棉靈威(alanycarb)、得滅克(aldicarb)、惡蟲威(bendiocarb)、免扶克(benfuracarb)、丁酮威(butocarboxim)、丁酮磯威(butoxycarboxim)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、丁基加保扶(carbosulfan)、殺蟲丹(ethiofencarb)、仲丁威(fenobucarb)、複滅蟎(formetanate)、呋線威(furathiocarb)、葉蟬散(isoprocarb)、滅賜克(methiocarb)、納乃得(methomyl)、速滅威(metolcarb)、歐殺滅(oxamyl)、比加普(pirimicarb)、安丹(propoxur)、硫敵克(thiodicarb)、久效威(thiofanox)、啞蚜威(triazamate)、混滅威(trimethacarb)、XMC、以及滅殺威(xylcarb)；或者有機磷酸酯類，如歐殺松(acephate)、亞滅松(azamethiphos)、穀速松-乙酯(azinphos-ethyl)、穀速松-甲酯(azinphos-methyl)、硫線磷(cadusafos)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、克芬松(chlorfenvinphos)、氯甲磷(chlormephos)、陶斯松-甲酯(chlorpyrifos-methyl)、蠅毒磷(coumaphos)、殺螟腈(cyanophos)、內吸磷-S-甲酯(demeton-S-methyl)、大利松(diazinon)、二氯松/DDVP (dichlorvos/DDVP)、雙特松(dicrotophos)、大滅松(dimethoate)、甲基毒蟲畏(dimethylvinphos)、二硫松(disulfoton)、EPN、愛殺松(ethion)、普伏松(ethoprophos)、氨磷磷(famphur)、芬滅松(fenamiphos)、撲滅松(fenitrothion)、芬殺松(fenthion)、噻唑磷(fosthiazate)、庚烯磷(heptenophos)、新菸磷(imicyafos)、異柳磷(isofenphos)、異丙基 O-(甲氧基胺基硫基磷鹽基)水楊酸

酯(isopropyl O-(methoxyaminothiophosphoryl) salicylate)、加福松(isoxathion)、馬拉硫磷(malathion)、滅蚜磷(mecarbam)、達馬松(methamidophos)、滅大松(methidathion)、美文松(mevinphos)、亞素靈(monocrotophos)、二溴磷(naled)、氧樂果(omethoate)、滅多松-甲酯(oxydemeton-methyl)、巴拉松-甲酯(parathion-methyl)、賽達松(phenthoate)、福瑞松(phorate)、裕必松(phosalone)、益滅松(phosmet)、福賜米松(phosphamidon)、巴賽松(phoxim)、亞特松-甲酯(pirimiphos-methyl)、布飛松(profenofos)、巴胺磷(propetamphos)、普硫松(prothiofos)、吡啉硫磷(pyraclufos)、噻嗪硫磷(pyridaphenthion)、喹硫磷(quinalphos)、治螟磷(sulfotep)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、雙硫磷(temephos)、託福松(terbufos)、樂本松(tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷(thiometon)、(triazophos)、三落松(triclorfon)、及蚜滅多(vamidothion)。

(2) GABA門控氯離子通道阻斷劑，如環二烯有機氯，如氯丹(chlordane)與安殺番(endosulfan)或苯基吡啉類(fiproles)，如乙蟲清(ethiprole)與費普尼(fipronil)。

(3) 鈉通道調節劑，如擬除蟲菊酯類(pyrethroids)，如阿納寧(acrinathrin)、丙烯除蟲菊酯(allethrin)、d-順-反丙烯除蟲菊酯、d-反丙烯除蟲菊酯、畢芬寧(bifenthrin)、生物丙烯除蟲菊酯(bioallethrin)、生物丙烯除蟲菊酯 s-環戊烯基異構物、苳呋菊酯(bioresmethrin)、乙氰菊脂(cycloprothrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、β-賽扶寧、賽洛寧(cyhalothrin)、λ-賽洛寧(lambda-cyhalothrin)、γ-賽洛寧(gamma-cyhalothrin)、賽滅寧(cypermethrin)、α-賽滅寧(alpha-cypermethrin)、β-賽滅寧(beta-cypermethrin)、θ-賽滅寧(theta-cypermethrin)、ξ-賽滅寧(zeta-cypermethrin)、賽酚寧[(1R)-反-異構物](cyphenothrin [(1R)-trans-isomer])、第滅寧(deltamethrin)、烯炔菊酯[(EZ)-(1R)-異構物](empenthrin [(EZ)-(1R)-isomer])、益化利(esfenvalerate)、依芬寧(etofenprox)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、護賽寧(flucythrinate)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、τ-福化利(tau-fluvalinate)、苳蟊醚(halfenprox)、依普寧(imiprothrin)、

噻噁菊酯(kadethrin)、甲氧苄氟菊酯(momfluorothrin)、百滅寧(permethrin)、苯醚菊酯[(1R)-反-異構物] (phenothrin [(1R)-trans-isomer])、普亞列寧(prallethrin)、除蟲菊素(除蟲菊)、列滅寧(resmethrin)、矽護芬(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin)、治滅寧(tetramethrin)、治滅寧[(1R)-異構物])、泰滅寧(tralomethrin)與拜富寧(transfluthrin)、或DDT或甲氧基氯。

(4) 菸鹼性乙醯膽鹼受體(nAChR)競爭性調節劑，如新菸鹼類(neonicotinoids)，如啉蟲脒(acetamiprid)、噁蟲胺(clothianidin)、呋蟲胺(dinotefuran)、吡蟲啉(imidacloprid)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、噁蟲啉(thiacloprid)與噁蟲嗪(thiamethoxam)、或菸鹼或氟啉蟲胺腈(sulfoxaflor)或氟吡呋喃酮(flupyradifurone)。

(5) 菸鹼性乙醯膽鹼受體(nAChR)異位調節劑，如賜諾殺(spinosyns)，如斯平托蘭(spinetoram)與賜諾殺(spinosad)。

(6) 羧胺酸門控氯離子通道(GluCl)異位調節劑，如阿維菌素類(avermectins)/米爾貝黴素類(milbemycins)，如阿巴汀(abamectin)、因滅汀苯甲酸酯(emamectin benzoate)、雷皮菌素(lepimectin)、及密滅汀(milbemectin)。

(7) 青春激素模擬物，如青春激素類似物，如烯蟲乙酯(hydroprene)、烯蟲炔酯(kinoprene)與美賜平(methoprene)、或芬諾克(fenoxycarb)或百利普芬(pyriproxyfen)。

(8) 其他非特異性(多位點)抑制劑，如烷基鹵化物，如甲基溴化物及其他烷基鹵化物；或者氯化苦(chloropicrine)或硫代氟化物或硼砂或吐酒石(tartar emetic)或甲基異氰酸酯產生劑，如棉隆(diazomet)與威百畝(metam)。

(9) 軟骨器官(Chordotonal Organs)之調節劑，如派滅淨(pymetrozine)或氟啉蟲醯胺(flonicamid)。

(10) 蠕蟲生長抑制劑，如克芬蟎(clofentezine)、合賽多(hexythiazox)、及氟蟎嗪(diflovidazin)或依殺蟎(etoxazole)。

(11) 昆蟲腸道膜之微生物破壞劑，如蘇力菌以色列亞種、球形芽孢桿菌 (*Bacillus sphaericus*)、蘇力菌鮎澤亞種、蘇力菌庫斯亞種、蘇力菌擬步行蟲亞種、及蘇力菌植物蛋白質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/35Ab1。

(12) 粒線體ATP合成酶之抑制劑，如ATP破壞劑，如汰芬諾克(diafenthiuron)或有機錫化合物，如偶氮環錫，錫蟎丹(cyhexatin)與芬布錫(fenbutatin oxide)，或毆蟎多(propargite)或四氯殺蟎砒(tetradifon)。

(13) 藉由破壞質子梯度之氧化磷醯化作用的非偶聯劑，如克凡派(chlorfenapyr)，DNOC，以及氟蟲胺(sulfluramid)。

(14) 菸鹼性乙醯膽鹼受體通道阻斷劑，如殺蟲磺(bensultap)、培丹鹽酸鹽(cartap鹽酸鹽)、殺蟲環(thiocylam)、及殺蟲雙-單鈉(thiosultap-sodium)。

(15) 幾丁質生合成(第0型)之抑制劑，如雙三氟蟲脲(bistrifluron)、克福隆(chlorfluazuron)、二福隆(diflubenzuron)、氟環脲(flucycloxuron)、氟芬隆(flufenoxuron)、六伏隆(hexaflumuron)、祿芬隆(lufenuron)、諾伐隆(novaluron)、多氟脲(noviflumuron)、得福隆(teflubenzuron)、及三福隆(triflumuron)。

(16) 幾丁質生合成(第1型)之抑制劑，如布芬淨(buprofezin)。

(17) 蛻皮破壞劑(特別是針對雙翅目(Diptera)，即雙足動物)，如賽滅淨(cyromazine)。

(18) 蛻皮激素受體協同劑，如環蟲醯肼(chromafenozide)、合芬隆(halofenozide)、滅芬諾(methoxyfenozide)、及得芬諾(tebufenozide)。

(19) 章魚胺受體協同劑，如三亞蟎(amitraz)。

(20) 粒線體複合物III電子傳遞抑制劑，如愛美松(hydramethylnone)或亞醯蟎(acequinocyl)或嘧蟎酯(flucrypyrim)。

(21) 粒線體複合物I電子傳遞抑制劑，如取自METI殺蟎劑之群組，如芬殺蟎(fenazaquin)、芬普蟎(fenpyroximate)、嘧蟎醚(pyrimidifen)、比達本(pyridaben)、

得芬瑞(tebufenpyrad)、及脫芬瑞(tolfenpyrad)或魚藤酮(Derris)。

(22) 電壓依賴性鈉通道阻斷劑，如因得克(indoxacarb)或氰氟蟲胺(metaflumizone)。

(23) 乙醯輔酶A羧化酶之抑制劑，如特窗酸與帖唑咪酸(tetronic and tetramic acid)衍生物，如賜派芬(spirodiclofen)、螺甲蟎酯(spiromesifen)、及螺蟲乙酯(spirotetramat)。

(24) 粒線體複合物IV電子傳遞抑制劑，如磷類，如磷化鋁、磷化鈣、磷與磷化鋅或氰化物，如氰化鈣、氰化鉀、及氰化鈉。

(25) 粒線體複合物II電子傳遞抑制劑，如 β -酮腈衍生物，如腈吡蟎酯(cyenopyrafen)與丁氟蟎酯(cyflumetofen)，以及甲醯苯胺類，如批氟布米德(pyflubumide)。

(28) 蘭諾定受體(Ryanodine receptor)調節劑，如二醯胺類，如氯蟲苯甲醯胺(chlorantraniliprole)、氰蟲醯胺(cyantraniliprole)、及氟蟲雙醯胺(flubendiamide)。

進一步之活性化合物，如雙丙環蟲酯(Afidopyropen)、阿福藍(Afoxolaner)、印苦棟子素、苯氯噻(Benclothiaz)、苯蟎特(Benzoximate)、畢芬載(Bifenazate)、溴蟲氟苯雙醯胺(Broflanilide)、溴蟎酯(Bromopropylate)、蟎離丹、氯普亞列寧、冰晶石(Cryolite)、環胺普羅(Cyclaniliprole)、環氧蟲啉(Cyclozaprid)、氯氟氰蟲醯胺(Cyhalodiamide)、二氯噻吡嘧啶(Dicloromezotiaz)、開樂散(Dicofol)、 ϵ -甲氧苄氟酯(epsilon-Momfluthrin)、氟滿喹(Flometoquin)、三氟咪唑醯胺(Fluazaindolizine)、氟噻蟲磺(Fluensulfone)、氟芬內林(Flufenerim)、氟菌蟎酯、丁烯氟蟲腈(Flufiprole)、氟己酮(Fluhexafon)、氟吡菌醯胺、氟雷拉納(Fluralaner)、氟甲醯胺(Fluxametamide)、呋喃蟲醯肼(Fufenozide)、戊吡蟲肼(Guadipyr)、七氟甲醚菊酯(Heptafluthrin)、氯噻啉(Imidaclothiz)、依普同、 κ -畢芬寧、 κ -七氟菊酯、洛替拉納(Lotilaner)、氯氟醚菊酯(Meperfluthrin)、吡蟲啉(Paichongding)、啉蟲丙醚(Pyridalyl)、吡氟喹啉(Pyrifluquinazon)、嘧蟎胺(Pyriminostrobin)、螺蟎雙酯

(Spirobudiclofen)、四氟醚菊酯(Tetramethylfluthrin)、四安利普(Tetraniliprole)、四氯蟲苯甲醯胺(Tetrachlorantraniliprole)、提戈蘭(Tigolaner)、提芬(Tioxazafen)、硫氟肟醚(Thiofluoximate)、三氟米比瑞(Triflumezopyrim)、及碘甲烷；另外以芽孢堅強桿菌(I-1582, BioNeem, Votivo)為主之調配物，以及下列化合物：1-{2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亞磺醯基]苯基}-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺(由WO2006/043635得知)(CAS 885026-50-6)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吡啶-3,4'-吡啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮(由WO2003/106457得知)(CAS 637360-23-7)、2-氯-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]吡啶-4-基}-4-(三氟甲基)苯基]異菸鹼醯胺(由WO2006/003494得知)(CAS 872999-66-1)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-4-羥基-8-甲氧基-1,8-二氮雜螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(由WO 2010052161得知)(CAS 1225292-17-0)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-側氧基-1,8-二氮雜螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙酯(由EP2647626得知)(CAS 1440516-42-6)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基吡啶-1-基)-5-氟嘧啶(由WO2004/099160得知)(CAS 792914-58-0)、PF1364 (由JP2010/018586得知)(CAS 1204776-60-2)、N-[(2E)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]吡啶-2(1H)-亞基]-2,2,2-三氟乙醯胺(由WO2012/029672得知)(CAS 1363400-41-2)、(3E)-3-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-亞吡啶基]-1,1,1-三氟-丙烷-2-酮(由WO2013/144213得知)(CAS 1461743-15-6)、N-[3-(苯甲基胺甲醯基)-4-氯苯基]-1-甲基-3-(五氟乙基)-4-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-羧醯胺(由WO2010/051926得知)(CAS 1226889-14-0)、5-溴-4-氯-N-[4-氯-2-甲基-6-(甲基胺甲醯基)苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)吡唑-3-羧醯胺(由CN103232431得知)(CAS 1449220-44-3)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異唑基]-2-甲基-N-(順-1-氧撐-3-噁丁環基)-苯甲醯胺、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異唑基]-2-甲基-N-(反-1-氧撐-3-噁丁環基)-苯甲醯胺與4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異唑基]-2-甲基-N-(順-1-氧撐-3-噁丁環基)苯甲醯胺(由WO 2013/050317 A1得知)(CAS 1332628-83-7)、N-[3-

氯-1-(3-吡啶基)-1*H*-吡唑-4-基]-*N*-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亞磺醯基]-丙醯胺、
 (+)-*N*-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1*H*-吡唑-4-基]-*N*-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亞磺醯基]-丙
 醯胺與(-)-*N*-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1*H*-吡唑-4-基]-*N*-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亞磺醯
 基]-丙醯胺(由WO 2013/162715 A2、WO 2013/162716 A2、US 2014/0213448 A1
 得知)(CAS 1477923-37-7)、5-[[*(2E)*-3-氯-2-丙烯-1-基]胺基]-1-[2,6-二氯-4-(三氟甲
 基)苯基]-4-[(三氟甲基)亞磺醯基]-1*H*-吡唑-3-腈(由CN 101337937 A得知)(CAS
 1105672-77-2)、3-溴-*N*-[4-氯-2-甲基-6-[(甲基胺基)硫基甲基]苯基]-1-(3-氯-2-吡
 啶基)-1*H*-吡唑-5-羧醯胺(Liudaibenji axuanan，由CN 103109816 A得知)(CAS
 1232543-85-9)、*N*-[4-氯-2-[(1,1-二甲基乙基)胺基]羰基]-6-甲基苯基]-1-(3-氯-2-
 吡啶基)-3-(氟甲氧基)-1*H*-吡唑-5-羧醯胺(由WO 2012/034403 A1得知)(CAS
 1268277-22-0)、*N*-[2-(5-胺基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-
 吡啶基)-1*H*-吡唑-5-羧醯胺(由WO 2011/085575 A1得知)(CAS 1233882-22-8)、
 4-[3-[2,6-二氯-4-[(3,3-二氯-2-丙烯-1-基)氧基]苯氧基]丙氧基]-2-甲氧基-6-(三氟
 甲基)-嘧啶(由CN 101337940 A得知)(CAS 1108184-52-6)、(*2E*)-與2(*Z*)-2-[2-(4-氰
 基苯基)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亞乙基]-*N*-[4-(二氟甲氧基)苯基]肼羧醯胺(由
 CN 101715774 A得知)(CAS 1232543-85-9)、環丙烷羧酸 3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-
 二甲基-4-(1*H*-苯并咪唑-2-基)苯酯(由CN 103524422 A得知)(CAS
 1542271-46-4)、(4*aS*)-7-氯-2,5-二氫-2-[(甲氧基羰基)[4-[(三氟甲基)硫基]苯基]胺
 基]羰基]茛並[1,2-*e*][1,3,4]二-4*a*(3*H*)-羧酸甲酯(由CN 102391261 A得知)(CAS
 1370358-69-2)、6-去氧-3-*O*-乙基-2,4-二-*O*-甲基-，1-[*N*-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-五氟乙
 氧基)苯基]-1*H*-1,2,4-三唑-3-基]苯基]胺甲酸酯]- α -*L*-吡喃甘露糖(由
 US 2014/0275503 A1得知)(CAS 1181213-14-8)、8-(2-環丙基甲氧基-4-三氟甲基-
 苯氧基)-3-(6-三氟甲基嗒-3-基)-3-氮雜雙環[3.2.1]辛烷(CAS 1253850-56-4)、(8-
 反)-8-(2-環丙基甲氧基-4-三氟甲基苯氧基)-3-(6-三氟甲基嗒-3-基)-3-氮雜雙環
 [3.2.1]辛烷(CAS 933798-27-7)、(8-順)-8-(2-環丙基甲氧基-4-三氟甲基-苯氧

基)-3-(6-三氟甲基嗒-3-基)-3-氮雜雙環[3.2.1]辛烷(由WO 2007040280 A1、WO 2007040282 A1得知)(CAS 934001-66-8)、N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)硫基]丙醯胺(由WO 2015/058021 A1、WO 2015/058028 A1得知)(CAS 1477919-27-9)與N-[4-(胺基硫基甲基)-2-甲基-6-[(甲基胺基)羰基]苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-羧醯胺(由CN 103265527 A得知)(CAS 1452877-50-7)、5-(1,3-二噁烷-2-基)-4-[[4-(三氟甲基)苯基]甲氧基]嘧啶(由WO 2013/115391 A1得知)(CAS 1449021-97-9)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-4-羥基-8-甲氧基-1-甲基-1,8-二氮雜螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(由WO 2010/066780 A1、WO 2011/151146 A1得知)(CAS 1229023-34-0)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-1-甲基-1,8-二氮雜螺[4.5]癸烷-2,4-二酮(由WO 2014/187846 A1得知)(CAS 1638765-58-8)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-1-甲基-2-側氧基-1,8-二氮雜螺[4.5]癸-3-烯-4-基-羧酸乙酯(由WO 2010/066780 A1、WO 2011/151146 A1得知)(CAS 1229023-00-0)、N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2(1H)-亞吡啶基]-2,2,2-三氟乙醯胺(由DE 3639877 A1、WO 2012029672 A1得知)(CAS 1363400-41-2)、[N(E)]-N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2(1H)-亞吡啶基]-2,2,2-三氟乙醯胺(由WO 2016005276 A1得知)(CAS 1689566-03-7)、[N(Z)]-N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2(1H)-亞吡啶基]-2,2,2-三氟乙醯胺(CAS 1702305-40-5)、3-內-3-[2-丙氧基-4-(三氟甲基)苯氧基]-9-[[5-(三氟甲基)-2-吡啶基]氧基]-9-氮雜雙環[3.3.1]壬烷(由WO 2011/105506 A1、WO 2016/133011 A1得知)(CAS 1332838-17-1)。

【0128】可與式(I)化合物及包含其之組成物混合之安全劑的實例為，如解草酮(benoxacor)、解毒啞(解草酯)(cloquintocet (-mexyl))、解草胺腈(cyometrinil)、可普磺醯胺、二氯丙烯胺(dichlormid)、解草唑(-乙酯)(fenchlorazole (-ethyl))、解草唑、解草啖(fencloirim)、解草安(flurazole)、肱草安(fluxofenim)、呋喃解草唑(furilazole)、雙苯噁啞酸(-乙酯)(isoxadifen (-ethyl))、吡啞解草酸(-二乙酯)(mefenpyr (-diethyl))、萘二甲酸酐、解草腈(oxabetrinil)、2-甲氧基-N-({4-[(甲基

胺甲醯基)胺基]苯基}磺醯基)苯甲醯胺(CAS 129531-12-0)、4-(二氯乙醯基)-1-氧雜-4-氮雜螺[4.5]癸烷(CAS 71526-07-3)、2,2,5-三甲基-3-(二氯乙醯基)-1,3-𠵼唑啉(CAS 52836-31-4)。

【0129】可與式(I)化合物及包含其之組成物混合之除草劑的實例為：

乙草胺(acetochlor)、活化酯(acibenzolar)、活化酯鈉、苯草醚(aclonifen)、甲草胺(alachlor)、二丙稀草胺(allidochlor)、禾草滅(alloxydim)、禾草滅鈉、莠滅淨(ametryn)、氨唑草酮(amicarbazone)、先甲草胺(amidochlor)、醯喃橫隆(amidosulfuron)、4-胺基-3-氯-6-(4-氯-2-氟-3-甲基苯基)-5-氟吡啶-2-羧酸、環丙嘧啶酸(aminocyclopyrachlor)、環丙嘧啶酸-鉀、環丙嘧啶酸-甲酯、氯胺吡啶酸(aminopyralid)、殺草強(amitrole)、氨基磺酸銨(ammonium sulfamate)、莎稗磷(anilofos)、橫草靈(asulam)、莠去津(atrazine)、唑啶草酮(azafenidin)、四唑喃磺隆(azimsulfuron)、氟丁醯草胺(beflubutamid)、草除靈(benazolin)、草除靈-乙酯、丁氣靈(benfluralin)、咲草黃(benfuresate)、苄嘧磺隆(bensulfuron)、苄嘧磺隆-甲酯、地散磷(bensulide)、滅草松(bentazone)、雙環橫草酮(benzobicyclon)、吡草酮(benzofenap)、雙環吡喃酮(bicyclopyrone)、必芬諾(bifenox)、畢拉草(bilanafos)、畢拉草-鈉、雙草醚(bispyribac)、雙草醚-鈉、除草定(bromacil)、溴丁醯草胺(bromobutide)、殺草全(bromofenoxim)、溴苯腈(bromoxynil)、溴苯腈丁酸酯、溴苯腈-鉀、溴苯腈庚酸酯與溴苯腈辛酸酯、輕草酮(busoxinone)、丁草胺(butachlor)、氣丙喃草酯(butafenacil)、抑草磷(butamifos)、丁稀草胺(butenachlor)、仲丁靈(butralin)、丁氧環酮(butroxydim)、丁草敵(butylate)、唑草胺(cafenstrole)、雙醯草胺(carbetamide)、唑草酯(carfentrazone)、唑草酯-乙酯(carfentrazone-ethyl)、草滅畏(chloramben)、氯溴隆(chlorbromuron)、伐草克(chlorfenac)、伐草克-鈉(chlorfenac-sodium)、燕麥酯(chlorfenprop)、整形醇(chlorflurenol)、整形醇-甲酯、氯草敏(chloridazon)、氯喃橫隆(chlorimuron)、氯喃橫隆-乙酯、氯酞醯亞胺(chlorophthalim)、綠麥隆(chlorotoluron)、氯釀酸-二甲

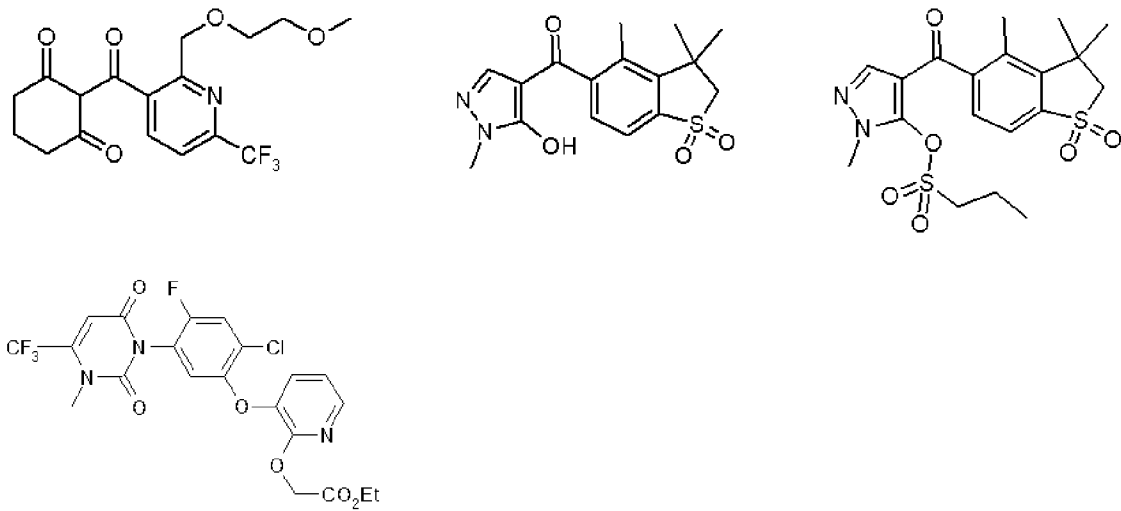
酯(chlorthal-dimethyl)、氯橫隆(chlorsulfuron)、吲哚酮草酯(cinidon)、吲哚酮草酯-乙酯、環庚草醚(cinmethylin)、醚橫隆(cinosulfuron)、氯噻草膦(clacyfos)、克草同(clethodim)、炔草酸(clodinafop)、炔草酸-炔丙酯、可滅蹤(clomazone)、稗草胺(clomeprop)、畢克草(clopyralid)、氯酯磺草胺(cloransulam)、氯酯磺草胺-甲酯、苣草隆(cumyluron)、氨基氰(cyanamide)、氰草津(cyanazine)、環草敵(cycloate)、環噻草特(cyclopyrimorate)、環磺隆(cyclosulfamuron)、環殺草(cycloxydim)、賽扶草(cyhalofop)、賽扶草-丁酯、環草津(cyprazine)、2,4-D、2,4-D-吡氧乙酸丁氧基、-丁基、-二甲基銨、-二乙醇胺、-乙基、-2-乙基己基、-異丁基、-異辛基、-異丙基銨、-鉀、-三異丙基銨與-三乙醇胺、2,4-DB、2,4-DB-丁基、-二甲基銨、-異辛基、-鉀、及-鈉、殺草隆(daimuron/dymron)、茅草枯(dalapon)、棉隆(dazomet)、正癸醇(n-decanol)、甜菜安(desmedipham)、脫甲苯磺醯基吡啶特(detosyl-pyrazolate, DTP)、麥草畏(dicamba)、敵草腈(dichlobenil)、2-(2,4-二氯苄基)-4,4-二甲基-1,2-噁唑烷-3-酮、2-(2,5-二氯苄基)-4,4-二甲基-1,2-噁唑烷-3-酮、滴丙酸(dichlorprop)、滴丙酸-P、禾草靈(diclofop)、禾草靈-甲酯、禾草靈-P-甲基、雙氯磺草胺(diclosulam)、苯敵快(difenzoquat)、吡氟草胺(diflufenican)、二氟吡隆(diflufenzopyr)、二氟吡隆-鈉、噁唑隆(dimefuron)、哌草丹(dimepiperate)、二甲草胺(dimethachlor)、異戊乙淨(dimethametryn)、二甲噻草胺(dimethenamid)、二甲噻草胺-P、戴美沙弗榮(dimetrasulfuron)、氮氣靈(dinitramine)、特樂酷(dinoterb)、雙苯噻草胺(diphenamid)、敵草快(diquat)、敵草快(diquat)、敵草快-二溴化物、氣硫草定(dithiopyr)、敵草隆(diuron)、DNOC、茵多酸(endothal)、EPTC、戊草丹(esprocarb)、乙丁稀氟靈(ethalfluralin)、胺苯橫隆(ethametsulfuron)、胺苯橫隆-甲酯、乙噻草酮(ethiozin)、乙氧呋草黃(ethofumesate)、氟乳醚(ethoxyfen)、氟乳醚-乙酯、乙氧喃磺隆(ethoxysulfuron)、乙氧苯草胺(etobenzanid)、F-9600、F-5231，即N-{2-氯-4-氟-5-[4-(3-氟丙基)-5-側氧基-4,5-二氫-1H-四唑-1-基]苯基}乙磺醯胺、F-7967，即3-[7-氯-5-氟-2-(三氟甲基)-1H-

苯并咪唑-4-基]-1-甲基-6-(三氟甲基)嘧啶-2,4(1H,3H)-二酮、噁唑禾草靈(fenoxaprop)、精噁唑禾草靈(fenoxaprop-P)、精噁唑禾草靈-乙酯、精噁唑禾草靈-P-乙酯、異噁苯磺(fenoxasulfone)、苯醌三酮(fenquinotrione)、四唑醯草胺(fentrazamide)、氟燕靈(flamprop)、氟燕靈-M-異丙酯、氟燕靈-M-甲酯、嘧啶磺隆(flazasulfuron)、雙氟磺草胺(florasulam)、伏寄普(fluazifop)、伏寄普-P、伏寄普-丁酯、伏寄普-P-丁酯、氟酮磺隆(flucarbazone)、氟酮磺隆-鈉、氟吡磺隆(flucetosulfuron)、氟消草(fluchloralin)、氟噻草胺(flufenacet)、氟噻嗪草酮(flufenpyr)、氟噻嗪草酮-乙酯、唑嘧磺草胺(flumetsulam)、氟烯草酸(flumiclorac)、氟烯草酸-戊酯、丙炔氟草胺(flumioxazin)、伏草隆(fluometuron)、抑草丁(flurenol)、抑草丁-丁酯、-銨二甲酯與-甲酯、乙羧氟草醚(fluoroglycofen)、乙羧氟草醚-乙酯、四氟丙酸(flupropanate)、氟啶嘧磺隆(flupyrsulfuron)、氟啶嘧磺隆-甲酯-鈉、氟啶草酮(fluridone)、氟咯草酮(flurochloridone)、氟草定(fluroxypyr)、氟草定-丁氧甲酯、呋草酮(flurtamone)、噻草酸(fluthiacet)、噻草酸-甲酯、氟磺胺草醚(fomesafen)、氟磺胺草醚-鈉、甲醯嘧磺隆(foramsulfuron)、殺木膦(fosamine)、草銨膦(glufosinate)、草銨膦-銨、草銨膦-P-鈉、草銨膦-P-銨、草銨膦-P-鈉、草甘膦(glyphosate)、草甘膦-單銨、-異丙基銨、-二銨、-二甲基銨、-鉀、-鈉、及-三甲基硫、H-9201，即O-(2,4-二甲基-6-硝基苯基)O-乙基異丙基硫代磷醯胺、氟氯吡啶酯(haloxifen)、氟氯吡啶酯-甲酯、氟硝磺醯胺(halosafen)、氯吡嘧磺隆(halosulfuron)、氯吡嘧磺隆-甲酯、精吡氟氯禾靈(haloxypfop)、精吡氟氯禾靈-P、精吡氟氯禾靈-乙氧乙酯、精吡氟氯禾靈-P-乙氧乙酯、精吡氟氯禾靈-甲酯、精吡氟氯禾靈-P-甲酯、六嗪同(hexazinone)、HW-02，即乙基-(2,4-二氯苯氧基)醋酸 1-二甲氧基磷醯基酯、咪草酸(imazamethabenz)、咪草酸-甲酯、甲氧咪草菸(imazamox)、甲氧咪草菸-銨、甲基咪草菸(imazapic)、甲基咪草菸-銨、依滅草(imazapyr)、依滅草-異丙基銨、滅草啞(imazaquin)、滅草啞-銨、咪草菸(imazethapyr)、咪草菸-銨、唑吡嘧磺隆(imazosulfuron)、茚草酮(indanofan)、茚

噻氟草胺(indaziflam)、碘甲磺隆(iodosulfuron)、碘甲磺隆-甲酯-鈉、碘苯腈(ioxynil)、碘苯腈-辛酸鹽、-鉀、及-鈉、艾分卡巴腈(ipfencarbazone)、異丙隆(isoproturon)、異惡隆(isouron)、異噁草胺(isoxaben)、異噁唑草酮(isoxaflutole)、卡草靈(karbutilate)、KUH-043，即3-([5-(二氟甲基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-基]甲基)磺醯基)-5,5-二甲基-4,5-二氫-1,2-噁唑、酮螺雜氧化物(ketospiradox)、乳氟禾草靈(lactofen)、環草定(lenacil)、利穀隆(linuron)、MCPA、MCPA-吡氧乙酸丁氧基、-二甲基銨、-2-乙基己基、-異丙基銨、-鉀、及-鈉、MCPB、MCPB-甲基、-乙基、及-鈉、2-[(4-氯-鄰用苯基)氧]丙酸(mecoprop)、2-[(4-氯-鄰用苯基)氧]丙酸-鈉、及-吡氧乙酸丁氧基、2-[(4-氯-鄰用苯基)氧]丙酸-P、2-[(4-氯-鄰用苯基)氧]丙酸-P-吡氧乙酸丁氧基、-二甲基銨、-2-乙基己基、及-鉀、苯噻醯草胺(mefenacet)、氯磺醯草胺(mefluidide)、甲磺胺磺隆(mesosulfuron)、甲磺胺磺隆-甲酯、甲基橫草酮(mesotrione)、甲基苯噻隆(methabenzthiazuron)、威百畝、噁唑醯草胺(metamifop)、苯噻草酮(metamitron)、吡唑草胺(metazachlor)、雙醚氯吡嘧磺隆(metazosulfuron)、甲基苯噻隆(methabenzthiazuron)、甲硫嘧磺隆(methiopyrisulfuron)、甲硫唑啉(methiozolin)、甲基異硫基氰酸酯、溴穀隆(metobromuron)、異丙甲草胺(metolachlor)、S-異丙甲草胺、磺草唑胺(metosulam)、甲氧隆(metoxuron)、賽克津(metribuzin)、甲磺隆(metsulfuron)、甲磺隆-甲酯、草達滅(molinate)、綠穀隆(monolinuron)、單嘧磺隆(monosulfuron)、單嘧磺隆-酯、MT-5950，即N-(3-氯-4-異丙基苯基)-2-甲基戊醯胺、NGGC-011、敵草胺(napropamide)、NC-310，即[5-(苄基氧基)-1-甲基-1H-吡唑-4-基](2,4-二氯苯基)甲酮、草不隆(neburon)、菸嘧磺隆(nicosulfuron)、壬酸(天竺葵酸)、達草滅(norflurazon)、油酸(脂肪酸)、坪草丹(orbencarb)、嘧苯胺磺隆(orthosulfamuron)、氮磺樂靈(oryzalin)、丙炔噁草酮(oxadiargyl)、噁草酮(oxadiazon)、環氧嘧磺隆(oxasulfuron)、噁噻草酮(oxaziclomefone)、乙氧氟草醚(oxyfluorfen)、巴拉刈(paraquat)、巴拉刈二氯化物、克草猛(pebulate)、二甲戊樂靈(pendimethalin)、平

速爛(penoxsulam)、五氯苯酚、環戊嘧草酮(pentoxazone)、烯草胺(pethoxamid)、石油、甜菜寧(phenmedipham)、胺氯吡啶酸(picloram)、氟吡草胺(picolinafen)、唑啉草酯(pinoxaden)、哌草磷(piperophos)、丙草胺(pretilachlor)、氟嘧磺隆(primisulfuron)、氟嘧磺隆-甲酯、胺基丙氟靈(prodiamine)、環苯草酮(profoxydim)、撲滅通(prometon)、撲草淨(prometryn)、撲草胺(propachlor)、敵稗(propanil)、啞草酯(propaquizafop)、撲滅津(propazine)、苯胺靈(propham)、異丙草胺(propisochlor)、丙苯磺隆(propoxycarbazone)、丙苯磺隆-鈉、丙嘧磺隆(propyrisulfuron)、戊炔草胺(propyzamide)、苄草丹(prosulfocarb)、氟磺隆(prosulfuron)、雙唑草腈(pyraclonil)、吡草醚(pyraflufen)、吡草醚-乙酯、磺醯草吡唑(pyrasulfotole)、吡唑特(pyrazolynate)、吡嘧磺隆(pyrazosulfuron)、吡嘧磺隆-乙酯、苄草唑(pyrazoxyfen)、草醚(pyribambenz)、草醚-異丙酯、草醚-丙酯、嘧啶𪔐草醚(pyribenzoxim)、稗草丹(pyributicarb)、吡啶達醇(pyridafol)、噻草特(pyridate)、環酯草醚(pyriftalid)、嘧草醚(pyriminobac)、嘧草醚-甲酯、嘧啶硫蕃(pyrimisulfan)、嘧硫草醚(pyriathiobac)、嘧硫草醚-鈉、嘧氧磺(pyroxasulfone)、甲氧磺草胺(pyroxsulam)、二氯喹啉酸(quinclorac)、喹草酸(quinmerac)、滅藻醯(quinoclamine)、快伏草(quizalofop)、快伏草-乙酯、快伏草-P、快伏草-P-乙酯、喹禾糠酯(quizalofop-P-tefuryl)、磺嘧磺隆(rimsulfuron)、苯嘧磺草胺(saflufenacil)、西殺草(sethoxydim)、環草隆(siduron)、西瑪津(simazine)、西草淨(simetryn)、SL-261、磺草酮(sulcotrione)、甲磺草胺(sulfentrazone)、甲嘧磺隆(sulfometuron)、甲嘧磺隆-甲酯、磺醯磺隆(sulfosulfuron)、順523、SYP-249，即1-乙氧基-3-甲基-1-側氧基丁-3-烯-2-基 5-[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]-2-硝基苯甲酸酯、SYP-300，即1-[7-氟-3-側氧基-4-(丙-2-炔-1-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯并𪔐𪔐-6-基]-3-丙基-2-硫基咪唑啉-4,5-二酮、2,3,6-TBA、TCA (三氯醋酸)、TCA-鈉、得甫隆(tebuthiuron)、特呋喃隆(tefuryltrione)、環磺酮(tembotrione)、吡喃草酮(tepraloxym)、特草定(terbacil)、特草靈(terbucarb)、甲氧去草淨(terbumeton)、

特丁津(terbuthylazine)、去草淨(terbutryn)、甲氧噻草胺(thenylchlor)、噻草定(thiazopyr)、噻酮磺隆(thiencarbazone)、噻酮磺隆-甲酯、噻吩磺隆(thifensulfuron)、噻吩磺隆-甲酯、禾草丹(thiobencarb)、噻苯那西(tiafenacil)、托吡酯(tolpyralate)、苯吡唑草酮(topramezone)、肟草酮(tralkoxydim)、氟酮磺草胺(triafamone)、野麥畏(tri-allate)、醚苯磺隆(triasulfuron)、三嗪氟草胺(triaziflam)、苯磺隆(tribenuron)、苯磺隆-甲酯、綠草定(triclopyr)、草達津(trietazine)、三氟啶磺隆(trifloxysulfuron)、三氟啶磺隆-鈉、三氟草嗪(trifludimoxazin)、氟樂靈(trifluralin)、氟胺磺隆(triflusulfuron)、氟胺磺隆-甲酯、三氟甲磺隆(tritosulfuron)、尿素硫酸酯、滅草猛(vernolate)、XDE-848、ZJ-0862，即3,4-二氯-N-{2-[(4,6-二甲氧基嘓啶-2-基)氧基]苄基}苯胺，以及下列化合物：



【0130】 植物生長調節劑之實例為：

阿拉酸式苯(acibenzolar)、阿拉酸式苯-S-甲酯、5-胺基乙醯丙酸、嘓啶醇(ancymidol)、6-苄基胺基嘓啶、油菜素內酯(brassinolide)、兒茶素、氯化克美素(chlormequat chloride)、坐果安(cloprop)、環丙酸醯胺(cyclanilide)、3-(環丙-1-烯基)丙酸、丁醯肼(daminozide)、棉隆、正癸醇、敵草克(dikegulac)、敵草克-鈉、茵多酸、茵多酸-二鉀、-二鈉、及-單(N,N-二甲基烷基銨)、益收生長素(ethephon)、氟節胺(flumetralin)、抑草丁、抑草丁-丁酯、調嘓醇(flurprimidol)、氯吡脲(forchlorfenuron)、赤黴酸(gibberellic acid)、依納素(inabenfide)、吡啶-3-乙酸

(IAA)、4-吡啶-3-基丁酸、稻瘟靈(isoprothiolane)、撲殺熱、茉莉酸(jasmonic acid)、馬來醯肼、氯壯棉素(mepiquat chloride)、1-甲基環丙烯、茉莉酸甲酯、2-(1-萘基)乙醯胺, 1-萘基乙酸、2-萘基氧乙酸、硝基酚酯混合物、巴克素、N-(2-苯基乙基)- β -丙胺酸、N-苯基鄰甲醯胺苯甲酸、調環酸(prohexadione)、調環酸-鈣、茉莉酮(prohydrojasmon)、柳酸、獨腳金內酯(strigolactone)、四氯硝基苯(tecnazene)、噻苯隆(thidiazuron)、三十烷醇(triacontanol)、抗倒酸(trinexapac)、抗倒酸-乙酯、茲多得(tsitodef)、烯效唑(uniconazole)、烯效唑-P。

方法與用途

【0131】 式(I)化合物及包含其之組成物具有強力的殺微生物活性。其可用於防治不需要的微生物，如不需要的真菌與細菌。其可特別適用於作物保護(其防治引起植物病害的微生物)或保護材料(如工業原料、木材、貯存品)，如下文中之更詳細描述。更具體地，式(I)化合物及包含其之組成物可用於保護種子、發芽之種子、發出之幼苗、植物、植物部位、果實、收成物、及/或土壤(其中植物從不需要之微生物中生長)。

【0132】 本文中使用的防治或控制包含對不需要之微生物的保護性、治癒性、及根除性處理。不需要的微生物可為致病性細菌、致病性病毒、致病性卵菌類、或致病性真菌，更具體地植物致病性細菌、植物致病性病毒、植物致病性卵菌類、或植物致病性真菌。如本文以下之詳述，彼等植物致病性微生物為廣泛之植物病害的致病因子。

【0133】 更具體地，式(I)化合物及包含其之組成物可作為殺真菌劑。針對本說明書之目的，術語「殺真菌劑」意指可用於作物保護的化合物或組成物，以防治不需要的真菌，如根腫菌綱(Plasmodiophoromycetes)、壺菌綱(Chytridiomycetes)、接合菌綱(Zygomycetes)、子囊菌綱(Ascomycetes)、擔子菌綱(Basidiomycetes)、及不完全菌綱(Deuteromycetes)，及/或用於防治卵菌類，更佳地用於防治擔子菌綱(Basidiomycetes)(引起銹病)。

【0134】 本發明亦有關一用於防治不需要的微生物(如植物致病性真菌、卵菌類、及細菌)的方法，其包含將至少一式(I)化合物或至少一 包含其之組成物施加至微生物及/或其棲地(施加至植物、植物部位、種子、果實、或植物生長之土壤)的步驟。

【0135】 典型上，當將本發明之化合物與組成物用於防治植物致病性真菌及/或植物致病性卵菌類之治療或保護性方法中時，可將有效的及其植物兼容量施加至植物、植物部位、果實、種子，或施加至植物生長之土壤或基質。可用於栽培植物之適用基質包括無機為主之基質，如礦棉，特別是石棉、珍珠岩、沙子、或礫石；有機基質，如泥炭、松樹皮、或木屑；以及石油為主之基質，如聚合物泡沫或塑料珠粒。有效及植物兼容量意指足以防治或破壞存在或易出沒於耕地上的真菌且不引起該作物任何明顯之植物毒性症狀的量。此量可在一廣泛範圍內變化，其取決於欲防治之真菌、作物類型、作物生長階段、氣候條件、及所使用之本發明相應化合物或組成物。此量可利用本領域技術人員能力範圍內之系統性場域試驗確定。

植物與植物部位

【0136】 式(I)化合物及包含其之組成物可施加至任何植物或植物部位。

【0137】 植物意指所有的植物與植物種群，如所需與不需要的野生植物或作物植物(包括天然存在的作物植物)。作物植物可為利用常規育種與優化方法或利用生物技術與基因工程方法或彼等方法之組合所取得之植物，包括基因改造植物(GMO或轉基因植物)及植物栽培種，其受到或不受到植物育種者權利的保護。

【0138】 植物部位應理解為意指植物在地面之上與之下的所有部位與器官，如枝條、葉、花、及根，其實例包括葉、針、莖、幹、花、子實體、果實、及種子，以及根、塊莖、及根莖。植物部位亦包括收成之材料及無性與有性繁殖材料，如插條、塊莖、根莖、條、及種子。

【0139】 可以本發明方法處理之植物包括以下：棉花、亞麻、藤步、果實、蔬菜，如薔薇科屬(*Rosaceae sp.*)(諸如梨果果實，如蘋果與梨，還有核果，如杏仁、櫻桃、扁桃、及桃，以及小果，如草莓)、茶藨子科屬(*Ribesioideae sp.*)、胡桃科屬(*Juglandaceae sp.*)、樺木科屬(*Betulaceae sp.*)、漆樹科屬(*Anacardiaceae sp.*)、殼鬥科屬(*Fagaceae sp.*)、桑科屬(*Moraceae sp.*)、木犀科屬(*Oleaceae sp.*)、繡線菊科屬(*Actinidaceae sp.*)、樟科屬(*Lauraceae sp.*)、芭蕉科屬(*Musaceae sp.*) (如咖啡)、山茶科屬(*Theaceae sp.*)、梧桐科屬(*Sterculiaceae sp.*)、芸香科屬(*Rutaceae sp.*)(如檸檬、橙、及葡萄柚)；茄科屬(*Solanaceae sp.*)(如番茄)、百合科屬(*Liliaceae sp.*)、菊科屬(*Asteraceae sp.*)(如萬苣)、傘形科屬(*Umbelliferae sp.*)、十字花科屬(*Cruciferae sp.*)、藜科屬(*Chenopodiaceae sp.*)、葫蘆科屬(*Cucurbitaceae sp.*)(如黃瓜(cucumber))、蔥科屬(*Alliaceae sp.*)(如韭蔥、洋蔥)、蝶形花科屬(*Papilionaceae sp.*)(如豌豆)；主要作物植物，如禾本科屬(*Gramineae sp.*)(如玉米、草皮、穀物如小麥、黑麥、水稻、大麥、燕麥、粟、及黑小麥)、菊科屬(*Asteraceae sp.*)(如向日葵)、十字花科屬(*Brassicaceae sp.*)(如白球甘藍、紅球甘藍、花椰菜(broccoli)、菜花(cauliflower)、球芽甘藍、小白菜、球莖甘藍、蘿蔔與油菜、芥菜、山葵、及水芹)、蝶形花亞科屬(*Fabaceae sp.*)(如菜豆、花生)、蝶形花科屬(*Papilionaceae sp.*)(如大豆)、茄科屬(如馬鈴薯)、藜科屬(如糖用甜菜、飼用甜菜、糖萵苣、甜菜根)；用於園區與林區之有用植物與觀賞植物；以及彼等植物各自之基因改造品種。

【0140】 在一些較佳之具體實施例中，野生植物物種與植物栽培種，或取自常規生物育種方法(如雜交或原生質體融合)之彼等及其部位係依據本發明之方法處理。

【0141】 在一些其他較佳之具體實施例中，由基因工程方法取得的轉基因植物與植物栽培種(視情況結合常規方法(基因改造生物))及其部位係依據本發明之方法處理。更佳地，商業上可購或所使用之植物栽培種之植物係依據本發明之

方法處理。植物栽培種應理解為意指具有新特性(「性狀」)，且藉由常規育種、誘變、或藉由重組型DNA技術取得的植物。其可為栽培種、品種、生物型、或基因型。

【0142】 本發明之方法可用於處理基因改造生物(GMOs)，如植物或種子。基因改造植物(或轉基因植物)為將異源性基因穩定整合至基因體中的植物。表述「異源性基因」基本上意指在植物外部提供或組裝的基因，且當導入核、葉綠體、或粒線體基因體中時，藉由表現感興趣之蛋白質或多胜肽或藉由下調或靜默存在於植物中的其他基因(如使用反義股技術、共抑制技術、RNA干擾–RNAi–技術或microRNA – miRNA技術)，賦予轉形之植物新的或改進的農藝或其他特性。位於基因體中之異源性基因亦稱作轉基因(transgene)。

【0143】 可利用上述揭示方法處理的植物與植物栽培種包括所有具有遺傳物質的植物，其賦予彼等植物特定優勢與適用性狀(不論是利用育種及/或生物技術方法取得)。

【0144】 可利用上述揭示方法處理的植物與植物栽培種包括對一或多個生物性脅迫具有抗性的植物與植物栽培種，亦即該植物對動物與微生物害蟲(如線蟲、昆蟲、蟎、植物致病性真菌、細菌、病毒、及/或類病毒)具有更好的防禦作用。

【0145】 可利用上述揭示方法處理的植物與植物栽培種包括彼等對一或多個非生物性脅迫具有抗性的植物。非生物性脅迫條件可能包括諸如，乾旱、低溫暴露、熱暴露、滲透性脅迫、洪水、土壤鹽分增加、礦物質暴露增加、臭氧暴露、高度光照暴露、氮營養素有限、磷營養素有限、及避光。

【0146】 可利用上述揭示方法處理的植物與植物栽培種包括彼等特徵為產率特徵增加的植物。該植物之產量增加可為諸如改進植物生理學、生長、及發育的結果，如水分利用效率、保水率、改進的氮利用、提高的碳同化、改進的光合作用、提高的發芽效率、及加速成熟。此外，產率亦可藉由改進的植物結構(在

脅迫性與非脅迫性條件下)的影響而提高，包括但不侷限於，提早開花、雜交種子產生的開花控制、幼苗活力、植物大小、節間數量與距離、根系生長、種子大小、果實大小、莢果大小、莢果或穗數、每一莢果或穗的種子數、種子質量、增強的種子填充、減少的種子散佈、降低的莢果裂開、及抗倒伏性(lodging)。其他產率特徵包括種子組成物，如碳水化合物含量與組成物(如棉花或澱粉)、蛋白質含量、油含量與組成物、營養價值、抗營養化合物的減少、改進的可加工性、及更好的貯存穩定性。

【0147】 可利用上述揭示方法處理的植物與植物栽培種包括雜交植物之植物與植物栽培種，其表現出雜種優勢或雜交活力的特徵，通常導致更高的產率、活力、健康、及對生物性脅迫與非生物性脅迫的抗性。

【0148】 可利用上述揭示方法處理的植物與植物栽培種(利用植物生物技術方法如基因工程取得)包括耐除草劑植物之植物與植物栽培種，即對一或多個給定之除草劑具有耐受性的植物。此類植物的取得可利用基因轉形或利用篩選含有賦予此除草劑耐受性之突變體的植物。

【0149】 可利用上述揭示方法處理的植物與植物栽培種(利用植物生物技術方法如基因工程取得)包括耐昆蟲轉基因植物之植物與植物栽培種，即對特定標的昆蟲具有耐受性的植物。此類植物的取得可利用基因轉形或利用篩選含有賦予此昆蟲耐受性之突變體的植物。

【0150】 可利用上述揭示方法處理的植物與植物栽培種(利用植物生物技術方法如基因工程取得)包括耐非生物性脅迫之植物與植物栽培種。此類植物的取得可利用基因轉形或利用篩選含有賦予此脅迫耐受性之突變體的植物。

【0151】 可利用上述揭示方法處理的植物與植物栽培種(利用植物生物技術方法如基因工程取得)包括顯示出收成產物之數量、質量、及/或貯存穩定性之改變及/或收成產物之特定成分性質改變的植物與植物栽培種。

【0152】 可利用上述揭示方法處理的植物與植物栽培種(利用植物生物技

術方法如基因工程取得)包括具有纖維性質改變之植物與植物栽培種(如棉花植物)。此類植物的取得可利用基因轉形或利用篩選含有賦予此纖維性質改變之突變體的植物。

【0153】 可利用上述揭示方法處理的植物與植物栽培種(利用植物生物技術方法如基因工程取得)包括具有油分佈特徵改變之植物與植物栽培種(如油菜或相關的蕓苔屬(*Brassica*)植物)。此類植物的取得可利用基因轉形或利用篩選含有賦予此油分佈特徵改變之突變體的植物。

【0154】 可利用上述揭示方法處理的植物與植物栽培種(利用植物生物技術方法如基因工程取得)包括具有種子破碎特徵改變之植物與植物栽培種(如油菜或相關的蕓苔屬植物)。此類植物的取得可利用基因轉形或利用篩選含有賦予此種子破碎特徵改變之突變體的植物，且包括具有種子破碎延遲或減少之植物，如油菜植物。

【0155】 可利用上述揭示方法處理的植物與植物栽培種(利用植物生物技術方法如基因工程取得)包括具有轉譯後蛋白質修飾模式改變之植物與植物栽培種(如菸草植物)。

病原體與病害

【0156】 上面揭示之方法可用於防治微生物，特別是植物致病性微生物(如植物致病性真菌)引起的病害，例如：

由以下病原體引起的白粉病病害，如布氏白粉菌種(*Blumeria species*)(如禾本科布氏白粉菌(*Blumeria graminis*))、蘋果白澀病菌種(如蘋果白澀病菌)、單囊殼種(*Sphaerotheca species*)(如單囊殼白粉菌(*Sphaerotheca fuliginea*))、鉤絲殼種(*Uncinula species*)(如葡萄鉤絲殼菌(*Uncinula necator*))；

由以下病原體引起的銹病病害，如膠鏽菌種(*Gymnosporangium species*)(如褐色膠鏽菌(*Gymnosporangium sabinae*))、它抱鏽種(*Hemileia species*)(如咖啡馬它抱鏽菌(*Hemileia vastatrix*))、層鏽菌種(*Phakopsora species*)(如豆薯層鏽菌

(*Phakopsora pachyrhizi*)或山馬幢層鏽菌(*Phakopsora meibomia*))、柄鏽菌種(*Puccinia species*)(如隱匿柄鏽菌(*Puccinia recondita*)、禾柄鏽菌(*Puccinia graminis*)、或條形鏽菌(*Puccinia striiformis*))、單胞鏽菌種(*Uromyces species*)(如菜豆黑銹病菌(*Uromyces appendiculatus*))；

由以下卵菌類族群病原體引起的病害，如白鏽種(*Albugo species*)(如白鏽菌(*Albugo Candida*))、盤梗黴菌種(*Bremia species*)(如萬苣盤梗黴菌(*Bremia lactucae*))、霜黴菌種(*Peronospora species*)(如碗豆霜黴菌(*Peronospora pisi*)或十字花科霜黴菌(*P.brassicae*))、疫病菌種(*Phytophthora species*)(如致病疫黴菌(*Phytophthora infestans*))、軸霜黴菌種(*Plasmopara species*)，如葡萄軸霜黴菌(*Plasmopara viticola*)、假霜黴菌種(*Pseudoperonospora species*)(如草假霜黴菌(*Pseudoperonospora humuli*)或古巴假霜黴菌(*Pseudoperonospora cubensis*))、草苗立枯病菌種(*Pythium species*)(如番薯白腐病菌(*Pythium ultimum*))；

由以下病原體引起的葉斑病與葉枯萎病病害，如鏈隔孢菌種(如馬鈴薯夏疫病菌)、恭菜斑點病菌種(*Cercospora species*)(如甜菜褐斑病菌(*Cercospora beticola*))、枝孢種(*Cladosporium species*)(如黃瓜枝孢菌(*Cladosporium cucumerinum*))、旋孢腔菌種(*Cochliobolus species*)(如禾旋孢腔菌(*Cochliobolus sativus*))(分生孢子形式：德氏黴屬(*Drechslera*)，同義詞：長蠕孢屬(*Helminthosporium*)或宮部旋孢腔菌(*Cochliobolus miyabeanus*)))、棉黑斑病菌種(*Colletotrichum species*)(如菜豆炭疽病菌(*Colletotrichum lindemuthianum*))、鏽斑病菌種(*Cycloconium species*)(如孔雀斑病菌(*Cycloconium oleaginum*))、間座殼種(*Diaporthe species*)(如柑桔間座殼(*Diaporthe citri*))、痂囊腔菌種(*Elsinoe species*)(如柑桔痂囊腔菌(*Elsinoe fawcettii*))、盤長孢種(*Gloeosporium species*)(如悅色盤長孢菌(*Gloeosporium laeticolor*))、小叢殼種(*Glomerella species*)(如圍小叢殼(*Glomerella cingulata*))、球座菌種(*Guignardia species*)(如葡萄球座菌(*Guignardia bidwelli*))、小球腔菌種(*Leptosphaeria species*)(如十字花科小球腔菌(*Leptosphaeria*

maculans))、稻痕菌種(*Magnaporthe species*)(如稻痕病菌(*Magnaporthe grisea*))、微座孢菌種(*Microdochium species*)(如雪黴微座孢菌(*Microdochium nivale*))、球腔菌種(*Mycosphaerella species*)(如禾生球腔菌(*Mycosphaerella graminicola*)、落花生球腔菌(*Mycosphaerella arachidicola*)或斐濟球腔菌(*Mycosphaerella fijiensis*))、暗球腔菌種(*Phaeosphaeria species*)(如穎枯殼針孢菌(*Phaeosphaeria nodorum*))、核腔菌種(*Pyrenophora species*)(如圓核腔菌(*Pyrenophora teres*)或偃麥草核腔菌(*Pyrenophora tritici repentis*))、柱隔孢菌種(*Ramularia species*)(如辛加柱隔孢菌(*Ramularia collo-cygni*)或白斑柱隔孢菌(*Ramularia areola*))、喙孢菌種(*Rhynchosporium species*)(如黑麥喙孢菌(*Rhynchosporium secalis*))、殼針孢菌種(*Septoria species*)(如斧菜小殼針孢菌(*Septoria apii*)或番前殼針孢菌(*Septoria lycopersici*))、殼多胞菌種(*Stagonospora species*)(如穎枯殼多孢菌(*Stagonospora nodorum*))、核瑚菌種(*Typhula species*)(如肉孢核瑚菌(*Typhula incarnata*))、蘋果黑星病菌種(*Venturia species*)(如蘋果黑星病菌(*Venturia inaequalis*))；

由以下病原體引起的根與莖病害，如伏革菌種(*Corticium species*)(如禾伏革菌(*Corticium graminearum*))、鏤孢菌種(*Fusarium species*)(如尖鏤孢菌(*Fusarium oxysporum*))、丁頁囊殼菌種(*Gaeumannomyces species*)(如禾丁頁囊殼(*Gaeumannomyces graminis*))、根瘤病菌種(*Plasmodiophora species*)(如十字花科蔬菜根瘤病菌(*Plasmodiophora brassicae*))、絲核菌種(*Rhizoctonia species*)(如立枯絲核菌(*Rhizoctonia solani*))、帚枝黴菌種(*Sarocladium species*)(如稻帚枝黴菌(*Sarocladium oryzae*))、小核菌種(*Sclerotium species*)(如稻小核菌(*Sclerotium oryzae*))、塔普斯菌種(*Tapesia species*)(如塔普斯梭狀芽胞桿菌(*Tapesia acuformis*))、根串珠黴菌種(*Thielaviopsis species*)(如根串珠黴菌(*Thielaviopsis basicola*))；

由以下病原體引起的穗與圓錐花序(包括玉米穗軸)病害，如鏈隔孢菌種(如鏈隔孢屬(*Alternaria spp.*))、麴菌種(*Aspergillus species*)(如黃麴菌(*Aspergillus*

flavus))、分枝孢子菌種(*Cladosporium species*)(如芽枝狀枝孢菌)、麥角菌種(*Claviceps species*)(如麥角菌(*Claviceps purpurea*))、鑲孢菌種(*Fusarium species*)(黃色鑲孢菌(*Fusarium culmorum*))、赤黴菌種(*Gibberella species*)(如玉蜀黍赤黴菌(*Gibberella zeae*))、小幽線殼菌種(*Monographella species*)(如雪腐小幽線殼菌(*Monographella nivalis*))、長穗菅茅斑葉病菌種(*Stagonospora species*)(如穎枯殼多孢菌(*Stagonospora nodorum*))；

由以下真菌病原體引起的黑穗病病害，如軸黑粉菌種(*Sphacelotheca species*)(如絲孢堆黑粉菌(*Sphacelotheca reiliana*))、腥黑粉菌種(*Tilletia species*)(如小麥網腥黑粉菌(*Tilletia caries*)或小麥矮腥黑粉菌(*Tilletia controversa*))、條黑粉菌屬種(*Urocystis species*)(如隱條黑粉菌(*Urocystis occulta*))、黑粉菌種(*Ustilago species*)(如裸黑粉菌(*Ustilago nuda*))；

由以下病原體引起的果實腐爛病害，如麴菌種(*Aspergillus species*) (如黃麴菌(*Aspergillus flavus*))、葡萄孢菌種(*Botrytis species*)(如灰葡萄孢菌(*Botrytis cinerea*))、青黴菌種(*Penicillium species*)(如擴展青黴菌(*Penicillium expansum*)或產紫青黴菌(*Penicillium purpurogenum*))、根黴菌種(*Rhizopus species*)(如匍莖根黴菌(*Rhizopus stolonifer*))、核盤菌種(*Sclerotinia species*)(如核盤菌(*Sclerotinia sclerotiorum*))、輪枝孢菌種(*Verticillium species*)(如黑白輪枝孢菌(*Verticillium alboatrum*))；

由以下病原體引起的種子傳播與土壤傳播的腐爛與萎蔫以及幼苗的病害，如鏈隔孢菌種(如甘藍鏈隔孢菌(*Alternaria brassicicola*))、絲囊黴菌種(*Aphanomyces species*)(如根腐絲囊黴菌(*Aphanomyces euteiches*))、殼二孢菌種(*Ascochyta species*)(如兵豆殼二孢菌(*Ascochyta lentis*))、麴菌種(*Aspergillus species*)(如黃麴菌(*Aspergillus flavus*))、分枝孢子菌種(*Cladosporium species*)(如分枝孢子菌(*Cladosporium herbarum*))、旋孢腔菌種(*Cochliobolus species*)(如禾旋孢腔菌(*Cochliobolus sativus*))(分生孢子形式：德氏黴屬(*Drechslera*)，同義詞：長儒

孢屬(*Helminthosporium*)))、棉黑斑病菌種(*Colletotrichum species*)(如球炭疽菌(*Colletotrichum coccodes*))、鏤孢菌種(*Fusarium species*)(如黃色鏤孢菌(*Fusarium culmorum*))、赤黴菌種(*Gibberella species*)(如玉蜀黍赤黴菌(*Gibberella zeae*))、殼球孢菌種(*Macrophomina species*)(如菜豆殼球孢菌(*Macrophomina phaseolina*))、微座孢菌種(*Microdochium species*)(如雪黴微座孢菌(*Microdochium nivale*))、小幽線殼菌種(*Monographella species*)(如雪腐小幽線殼菌(*Monographella nivalis*))、青黴菌種(*Penicillium species*)(如擴展青黴菌(*Penicillium expansum*))、莖點黴菌種(*Phoma species*)(如黑腔莖點黴菌(*Phoma lingam*))、擬莖點黴菌種(*Phomopsis species*)(如大豆擬莖點黴菌(*Phomopsis sojae*))、疫病菌種(*Phytophthora species*)(如惡疫黴菌(*Phytophthora cactorum*))、核腔菌種(*Pyrenophora species*)(如麥類核腔菌(*Pyrenophora graminea*))、梨孢菌種(*Pyricularia species*)(如稻梨孢菌(*Pyricularia oryzae*))、草苗立枯病菌種(*Pythium species*)(如番薯白腐病菌(*Pythium ultimum*))、絲核菌種(*Rhizoctonia species*)(如立枯絲核菌(*Rhizoctonia solani*))、根黴菌種(*Rhizopus species*)(如米根黴菌(*Rhizopus oryzae*))、小核菌種(*Sclerotium species*)(如齊整小核菌(*Sclerotium rolfsii*))、殼針孢菌種(*Septoria species*)(如穎枯殼針孢菌(*Septoria nodorum*))、核瑚菌種(*Typhula species*)(如肉孢核瑚菌(*Typhula incarnata*))、輪枝孢菌種(*Verticillium species*)(如大剛花輪枝孢菌(*Verticillium dahliae*))；

由以下病原體引起的癌症、膽囊、掃帚(witches' broom)病害，如叢赤殼種(*Nectria species*)(如仁果幹癌叢赤殼菌(*Nectria galligena*))；

由以下病原體引起的萎蔫病害，如鏈核盤菌種(*Monilinia species*)(如核果鏈核盤菌(*Monilinia laxa*))；

由以下病原體引起的葉、花與果實的變形，如外擔菌種(*Exobasidium species*)(如壞損外擔菌(*Exobasidium vexans*))、外囊菌種(*Taphrina species*)(如桃外囊菌(*Taphrina deformans*))；

由以下病原體引起的木本植物退化性病害，如依科菌種(*Esca species*)(如根黴格孢菌(*Phaemoniella chlamydospora*)、雞腿蘑絲孢菌(*Phaeoacremonium aleophilum*)或地中海孢孔菌(*Fomitiporia mediterranea*))、靈芝菌種(*Ganoderma species*)(如島靈芝菌(*Ganoderma boninense*))；

由以下病原體引起的花與種子的病害，如葡萄孢菌種(*Botrytis species*)(如灰葡萄孢菌(*Botrytis cinerea*))；

由以下病原體引起的植物塊莖病害，如絲核菌種(*Rhizoctonia species*)(如立枯絲核菌(*Rhizoctonia solani*))、長蠕孢菌種(*Helminthosporium species*)(如前病長蟲需孢菌(*Helminthosporium solani*))；

由以下細菌性病原體引起的病害，如黃單胞菌種(*Xanthomonas species*)(如稻黃單胞菌白葉枯變種(*Xanthomonas campestris* pv.*oryzae*))、假單胞菌種(*Pseudomonas species*)(如丁香假單胞菌黃瓜致病變種(*Pseudomonas syringae* pv.*lachrymans*))、伊文氏桿菌種(*Erwinia species*)(如梨及蘋果火傷病菌(*Erwinia amylovora*))。

種子處理

【0157】 用於防治不需要的微生物的方法可用於保護種子免於植物致病性微生物(如真菌)。

【0158】 本文中使用的術語「種子」包括休眠種子、發芽種子、預發芽種子、及帶有根與葉的種子。

【0159】 因此，本發明亦有關一用於保護種子及/或作物免於不需要的微生物(如細菌或真菌)的方法，其包含以一或多個式(I)化合物或包含其之組成物處理種子的步驟。以式(I)化合物或包含其之組成物處理種子不僅保護種子免於植物致病性微生物，還可使植物、出苗、及出苗後之植物發芽。

【0160】 種子處理可在播種前、播種時、或播種後不久進行。

【0161】 當在播種之前進行種子處理時(如所謂的在種子上施加)，種子處

理之進行可如下：可將種子置於一具有所需量之式(I)化合物或包含其之組成物(就這樣或稀釋後)之混合器中，使種子與式(I)化合物或包含其之組成物混合，直到種子達均勻分佈。若合適，隨後可將種子乾燥。

【0162】 本發明亦有關以一或多個式(I)化合物或包含其之組成物處理的種子。如前述，經處理之種子的用途不僅可在播種之前與之後保護種子免於不需要的微生物(如植物致病性真菌)，還可保護發芽的植物與從該處理之種子中萌發的幼苗。有害生物對作物植物造成的損害，很大一部分是由於植物在播種之前或發芽之後的種子感染所引起。此階段特別關鍵，係因生長中之植物的根與芽特別敏感，即使很小的損害亦可導致植物死亡。

【0163】 因此，本發明亦有關一用於保護種子、發芽植物、及出芽幼苗的方法，更一般而言係有關一用於保護作物免於植物致病性微生物的方法，其包含使用由一或多個式(I)化合物或包含其之組成物處理之種子的步驟。

【0164】 較佳地，種子之處理狀態為，在處理過程中足夠穩定且不發生損害。一般而言，可在收成與播種後之間的任何時間處理種子。常規為使用從植物中分離出且無穗軸、殼、莖、表皮、根毛、或果肉的種子。舉例而言，可使用生成、清潔、及乾燥至水分含量小於15重量%的種子。或者，亦可使用乾燥後的種子，如以水處理後再次乾燥的種子，或在剛灌注(priming)後之種子，或貯存在灌注條件下的種子或預發芽的種子，或播種在苗圃、托盤、膠帶、或紙上的種子。

【0165】 施加至種子之式(I)化合物或包含其之組成物的量典型上使得種子的發芽不受損害，或使所得之植物不損壞。必須確保這一點，特別是在活性成分在特定施加量之下呈現植物毒性作用的情況中。當欲施加至種子之式(I)化合物或包含其之組成物的量確定時，亦應考慮到轉基因植物的固有表現型，以達到利用最小量之式(I)化合物或包含其之組成物達到最佳的種子與發芽植物保護效果。

【0166】如上述，式(I)化合物可直接施加至種子，即不使用任何其他組分且無需稀釋，或可施加包含式(I)化合物之組成物。較佳地，組成物以任何適用形式施加至種子。適用調配物之實例包括溶液、乳劑、懸浮液、粉末、泡沫、漿液、或與其他用於種子之塗佈組成物的組合(如成膜材料、粒化材料)、鐵粉或其他金屬粉末、顆粒、用於使種子失活之塗佈材料、及ULV調配物。調配物可為即用型調配物，或可為在使用前需要稀釋的濃縮物。

【0167】彼等調配物係以已知方式製備，如藉由將活性成分或其混合物與常規之添加劑(如常規之增效劑與溶劑或稀釋劑、染料、濕潤劑、分散劑、乳化劑、消泡劑、防腐劑、次級增稠劑、黏著劑、吉貝素、及水)混合。

【0168】彼等調配物係以已知方式製備，如藉由將活性成分或活性成分結合物與常規之添加劑(如常規之增效劑與溶劑或稀釋劑、染料、濕潤劑、分散劑、乳化劑、消泡劑、防腐劑、次級增稠劑、黏著劑、吉貝素、及水)混合。

【0169】可存在於種子塗佈調配物中之適用染料為常規用於此類目的所有染料。亦可使用微溶於水的顏料或溶於水的染料。實例包括名稱為羅丹明B、C.I.顏料紅色112號、及C.I.溶劑紅色1號的染料。可存在於種子塗佈調配物中之適用濕潤劑為所有促進潤濕的物質，其常規用於活性農業化學成分之調配。偏好使用的是烷基萘磺酸酯類，如二異丙基萘磺酸酯或二異丁基萘磺酸酯。可存在於種子塗佈調配物中之適用分散劑及/或乳化劑為常規用於活性農業化學成分之調配的所有非離子性、陰離子性、及陽離子性分散劑。偏好使用的是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。適用之非離子性分散劑包括尤其是環氧乙烷/環氧丙烷嵌段聚合物、烷基酚聚乙二醇醚類與三苯乙基酚聚乙二醇醚、及其磷酸化或硫酸化之衍生物。適用之陰離子性分散劑為尤其是木質素磺酸酯類(lignosulfonates)、聚丙烯酸鹽類、及芳基磺酸酯/甲醛縮合物。可存在於種子塗佈調配物中之適用消泡劑為常規用於活性農業化學成分之調配的所有抑泡物質。偏好使用的是聚矽氧消泡劑與硬脂酸鎂。可存在

於種子塗佈調配物中之適用防腐劑為可在農業化學組成物中用於此類目的之所有物質。實例包括雙氯酚與苧醇半縮醛。可存在於種子塗佈調配物中之適用次級增稠劑為可在農業化學組成物中用於此類目的之所有物質。較佳之實例包括纖維素衍生物、丙烯酸衍生物、黃原膠、改性黏土、及細分之二氧化矽。可存在於種子塗佈調配物中之適用黏著劑為在種子塗佈產品中適用之所有常規黏合劑。較佳之實例包括聚乙烷基氫吡咯酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙醇、及羥乙基纖維素。

【0170】 式(I)化合物及包含其之組成物係適合保護用於農業、溫室、森林、或園藝中之任何植物品種的種子。更特別的是，種子為穀物(如小麥、大麥、黑麥、小米、黑小麥、及燕麥)、油菜、玉米、棉花、大豆、水稻、馬鈴薯、向日葵、豆類、咖啡、豌豆、甜菜(如糖用甜菜與飼用甜菜)、花生、蔬菜(如番茄、黃瓜、洋蔥、及生菜)、草坪、及觀賞植物。特別重要的是小麥、大豆、油菜、玉米、及水稻種子的處理。

【0171】 式(I)化合物或包含其之組成物可用於處理轉基因種子，特別是能表現對抗害蟲、除草劑破壞、或非生物性脅迫之蛋白質的植物種子，從而提高保護作用。與藉由表現形成之物質的交互作用，亦可產生協同作用。

線蟲

【0172】 在本發明上下文中，術語「線蟲」包含線蟲門的所有物種，且在此特別指在植物或真菌(如滑刃目(Aphelenchida)、根瘤線蟲目(Meloidogyne)、墊刃目(Tylenchida)、及其他物種)上，或者另外在人類與動物(如毛形亞目(Trichinellida)、墊刃目(Tylenchida)、小桿亞目(Rhabditida)、及旋尾目(Spirurida)之物種)上或在彼等活的生物體中或上引起傷害的寄生蟲物種，以及其他的寄生性蠕蟲。

【0173】 在如本文所述，作物保護中的殺線蟲劑能夠防治線蟲。

【0174】 術語「防治線蟲」意指殺死線蟲，或防止或阻礙其發育或其生長，

或防止或阻礙其穿透至植物組織中或吮吸在植物組織上。

【0175】 在此，化合物的效力係藉由比較以式(I)化合物處理之植物或植物部位或經處理之土壤與未經處理之植物或植物部位或未經處理之土壤(100%)之間的線蟲死亡率、蟲癭形成、囊胞形成、每單位體積土壤之線蟲密度、每一根之線蟲密度、每單位體積土壤之線蟲卵數量、活動力而測定。較佳地，與未經處理之植物、植物部位或未經處理之土壤相比，所達成的降低率較佳為25-50%，更佳為51-79%，且最佳為降低80至100%之完全殺死或完全防止線蟲發育與生長。如本文所述之線蟲的防治亦包含防治線蟲繁殖(囊胞與/或卵之發育)。式(I)化合物亦可用於保持植物或動物健康，且其可用於治療性、預防性、或全面性的線蟲防治。

【0176】 熟諳此項技術者已知用於測定線蟲之死亡率、蟲癭形成、囊胞形成、每單位體積土壤之線蟲密度、每一根之線蟲密度、每單位體積土壤之線蟲卵數量、活動力之方法。

【0177】 式(I)化合物之用途可保持植物健康，且亦包含降低由線蟲所引起的傷害及增加收成產率。

【0178】 在本發明上下文中，術語「線蟲」意指植物線蟲，其包含所有損害植物的線蟲。植物線蟲包含植物寄生性線蟲與土壤傳播性線蟲。植物寄生性線蟲包括體外寄生蟲，如劍線蟲屬(*Xiphinema* spp.)、長針線蟲屬(*Longidorus* spp.)、及毛刺線蟲屬(*Trichodorus* spp.)；半寄生性線蟲，如半穿刺線蟲屬(*Tylenchulus* spp.)；遊走性體內寄生性線蟲，如短體線蟲屬(*Pratylenchus* spp.)、穿孔線蟲屬(*Radopholus* spp.)、及盾線蟲屬(*Scutellonema* spp.)；非遊走性寄生性線蟲，如包囊線蟲屬(*Heterodera* spp.)、黃金線蟲屬(*Globodera* spp.)、及根瘤線蟲屬(*Meloidogyne* spp.)；以及莖與葉部體內寄生性線蟲，如莖線蟲屬(*Ditylenchus* spp.)、滑刃線蟲屬(*Aphelenchoides* spp.)、及潛根線蟲屬(*Hirschmaniella* spp.)。特別傷害根部的寄生性土壤線蟲為諸如包囊線蟲屬(*Heterodera*)或黃金線蟲屬

(Globodera)之形成孢囊的線蟲，及/或根瘤線蟲屬(Meloidogyne)之根癭線蟲。彼等屬類之傷害性物種為諸如南方根瘤線蟲(Meloidogyne incognita)、大豆包囊線蟲(Heterodera glycines)(大豆囊胞線蟲)、馬鈴薯包囊線蟲(Globodera pallida)、及馬鈴薯黃金線蟲(Globodera rostochiensis)(黃色馬鈴薯囊胞線蟲)，彼等物種被本發明上下文所述之化合物有效地防治。然而，本發明上下文所述之化合物的用途不以任何方式受限於彼等屬類或物種，並亦以相同的方式延伸至其他線蟲。

【0179】植物線蟲包括，如居農野外墊刃線蟲(Aglenchus agricola)、小麥腫癭線蟲(Anguina tritici)、花生滑刃線蟲(Aphelenchoides arachidis)、草莓滑刃線蟲(Aphelenchoides fragariae)與及莖與葉內寄生蟲滑刃線蟲屬(Aphelenchoides spp.)、細小刺線蟲(Belonolaimus gracilis)、長尾刺線蟲(Belonolaimus longicaudatus)、諾頓刺線蟲(Belonolaimus nortoni)、椰子傘滑刃線蟲(Bursaphelenchus cocophilus)、狐尾傘滑刃線蟲(Bursaphelenchus eremus)、松材線蟲(Bursaphelenchus xylophilus)、以及傘滑刃線蟲屬(Bursaphelenchus spp.)、瘟疫壞死線蟲(Cacopaurus pestis)、彎曲小環線蟲(Criconemella curvata)、刻線小環線蟲(Criconemella onoensis)、裝飾小環線蟲(Criconemella ornata)、胡桃小環線蟲(Criconemella rusium)、薄葉小環線蟲(Criconemella xenoplax (=異盤間環線蟲(Mesocriconema xenoplax)))與環紋線蟲屬(Criconemella spp.)、弗尼亞輪線蟲(Criconemoides ferniae)、歐諾輪線蟲(Criconemoides onoense)、飾頂輪線蟲(Criconemoides ornatum)與輪線蟲屬(Criconemoides spp.)、馬鈴薯腐敗線蟲(Ditylenchus destructor)、莖線蟲(Ditylenchus dipsaci)、蘑菇莖線蟲(Ditylenchus myceliophagus)與莖與葉內寄生蟲莖線蟲屬、異頭錐線蟲(Dolichodorus heterocephalus)、馬鈴薯包囊線蟲(=Heterodera pallida)、馬鈴薯黃金線蟲(yellow potato cyst nematode)、枯萎黃金線蟲(Globodera solanacearum)、菸草黃金線蟲(Globodera tabacum)、維吉尼亞球形包囊線蟲(Globodera virginia)與非遷移孢囊形成寄生蟲胞囊線蟲屬(Globodera spp.)、雙角螺旋線蟲(Helicotylenchus digonicus)、

雙宮螺旋線蟲(*Helicotylenchus dihystera*)、赤色螺旋線蟲(*Helicotylenchus erythrine*)、多帶螺旋線蟲(*Helicotylenchus multicinctus*)、矮小螺旋線蟲(*Helicotylenchus nannus*)、偽強壯螺旋線蟲(*Helicotylenchus pseudorobustus*)與螺旋線蟲屬(*Helicotylenchus* spp.)、半鞘線蟲屬(*Hemicriconemoides*)、花生鞘線蟲(*Hemicycliophora arenaria*)、裸出鞘線蟲(*Hemicycliophora nudata*)、塔堅鞘線蟲(*Hemicycliophora parvana*)、禾谷包囊線蟲(*Heterodera avenae*)、蕓薹包囊線蟲(*Heterodera cruciferae*)、大豆線蟲(*Heterodera glycines*)(大豆包囊線蟲)、稻包囊線蟲(*Heterodera oryzae*)、甜菜包囊線蟲(*Heterodera schachtii*)、玉米包囊線蟲(*Heterodera zae*)與非遷移孢囊形成寄生蟲包囊線蟲屬(*Heterodera* spp.)、細微潛根線蟲(*Hirschmaniella gracilis*)、稻米潛根線蟲(*Hirschmaniella oryzae*)、刺尾潛根線蟲(*Hirschmaniella spinicaudata*)與莖與葉內寄生蟲潛根線蟲屬(*Hirschmaniella* spp.)、埃及紐帶線蟲(*Hoplolaimus aegyptii*)、加州紐帶線蟲(*Hoplolaimus californicus*)、哥倫布紐帶線蟲(*Hoplolaimus columbus*)、帽狀紐帶線蟲(*Hoplolaimus galeatus*)、印度紐帶線蟲(*Hoplolaimus indicus*)、大針紐帶線蟲(*Hoplolaimus magnistylus*)、擬粗壯紐帶線蟲(*Hoplolaimus pararobustus*)、非洲長針線蟲(*Longidorus africanus*)、短環長針線蟲(*Longidorus breviannulatus*)、橫帶長針線蟲(*Longidorus elongatus*)、禿頂長針線蟲(*Longidorus laevicapitatus*)、藤蔓長針線蟲(*Longidorus vineicola*)以及體外寄生蟲長針線蟲屬(*Longidorus* spp.)、高粱根瘤線蟲(*Meloidogyne acronea*)、非洲根瘤線蟲(*Meloidogyne africana*)、花生根瘤線蟲(*Meloidogyne arenaria*)、花生根瘤線蟲湯氏亞種(*Meloidogyne arenaria thamesi*)、甘藍根瘤線蟲(*Meloidogyne artiella*)、奇氏根瘤線蟲(*Meloidogyne chitwoodi*)、咖啡根瘤線蟲(*Meloidogyne coffeicola*)、衣索比亞根瘤線蟲(*Meloidogyne ethiopica*)、短小根瘤線蟲(*Meloidogyne exigua*)、偽根瘤線蟲(*Meloidogyne fallax*)、草生根瘤線蟲(*Meloidogyne graminicola*)、禾本科根瘤線蟲(*Meloidogyne graminis*)、北方根瘤線蟲(*Meloidogyne hapla*)、南方根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*)、南方根瘤線蟲亞

力塔亞種(*Meloidogyne incognita acrita*)、爪哇根瘤線蟲(*Meloidogyne javanica*)、吉庫尤根瘤線蟲(*Meloidogyne kikuyensis*)、小根瘤線蟲(*Meloidogyne minor*)、納西根瘤線蟲(*Meloidogyne naasi*)、咖啡根瘤線蟲(*Meloidogyne paranaensis*)、泰晤士根瘤線蟲(*Meloidogyne thamesi*)與非遷移寄生蟲根瘤線蟲屬(*Meloidogyne* spp.)、瓢線蟲屬(*Meloinema* spp.)、假根瘤線蟲(*Nacobbus aberrans*)、擬莖線蟲(*Neotylenchus vigissi*)、假牆草擬滑刃線蟲(*Paraphelenchus pseudoparietinus*)、葱擬毛刺線蟲(*Paratrichodorus allius*)、裂片擬毛刺線蟲(*Paratrichodorus lobatus*)、小擬毛刺線蟲(*Paratrichodorus minor*)、短小擬毛刺線蟲(*Paratrichodorus nanus*)、胼胝擬毛刺線蟲(*Paratrichodorus porosus*)、光滑擬毛刺線蟲(*Paratrichodorus teres*)與擬毛刺線蟲屬(*Paratrichodorus* spp.)、鉤針線蟲(*Paratylenchus hamatus*)、微小針線蟲(*Paratylenchus minutus*)、突出針線蟲(*Paratylenchus projectus*)與針線蟲屬(*Paratylenchus* spp.)、敏捷短體線蟲(*Pratylenchus agilis*)、亞倫氏短體線蟲(*Pratylenchus allenii*)、安地斯短體線蟲(*Pratylenchus andinus*)、極短尾短體線蟲(*Pratylenchus brachyurus*)、小麥短體線蟲(*Pratylenchus cerealis*)、咖啡短體線蟲(*Pratylenchus coffeae*)、刻痕短體線蟲(*Pratylenchus crenatus*)、德氏短體線蟲(*Pratylenchus delattrei*)、吉伯氏短體線蟲(*Pratylenchus giibbicaudatus*)、古迪氏短體線蟲(*Pratylenchus goodeyi*)、彎鉤短體線蟲(*Pratylenchus hamatus*)、六裂短體線蟲(*Pratylenchus hexincisus*)、盧斯短體線蟲(*Pratylenchus loosi*)、落選短體線蟲(*Pratylenchus neglectus*)、穿刺短體線蟲(*Pratylenchus penetrans*)、草地短體線蟲(*Pratylenchus pratensis*)、斯克里布納短體線蟲(*Pratylenchus scribneri*)、大麥短體線蟲(*Pratylenchus teres*)、索氏短體線蟲(*Pratylenchus thornei*)、傷殘短體線蟲(*Pratylenchus vulnus*)、玉米短體線蟲(*Pratylenchus zeae*)與遷移體內寄生蟲短體線蟲屬(*Pratylenchus* spp.)、微小假海矛線蟲(*Pseudohalenchus minutus*)、平滑墊刃線蟲(*Psilenchus magnidens*)、膨大平滑墊刃線蟲(*Psilenchus tumidus*)、墨西哥玉米胞囊線蟲(*Punctodera chalcoensis*)、銳利五溝線蟲(*Quinisulcius acutus*)、柑橘穿孔

線蟲(*Radopholus citrophilus*)、香蕉穿孔線蟲(*Radopholus similis*)、遷移體內寄生蟲穿孔線蟲屬(*Radopholus* spp.)、北方腎形線蟲(*Rotylenchulus borealis*)、微小腎形線蟲(*Rotylenchulus parvus*)、腎形線蟲(*Rotylenchulus reniformis*)與腎形線蟲屬(*Rotylenchulus* spp.)、直溝盤旋線蟲(*Rotylenchus laurentinus*)、大囊盤旋線蟲(*Rotylenchus macrodoratus*)、強壯盤旋線蟲(*Rotylenchus robustus*)、單型盤旋線蟲(*Rotylenchus uniformis*)與盤旋線蟲屬(*Rotylenchus* spp.)、小尾盾線蟲(*Scutellonema brachyurum*)、山藥螺旋線蟲(*Scutellonema bradys*)、卡維內斯螺旋線蟲(*Scutellonema clathricaudatum*)與遷移體內寄生蟲盾線蟲屬(*Scutellonema* spp.)、亞粒線蟲(*Subanguina radiciola*)、菸鹼頭線蟲(*Tetylenchus nicotianae*)、圓筒毛刺線蟲(*Trichodorus cylindricus*)、細小毛刺線蟲(*Trichodorus minor*)、原始毛刺線蟲(*Trichodorus primitivus*)、普希毛刺線蟲(*Trichodorus proximus*)、相似毛刺線蟲(*Trichodorus similis*)、大蒜毛刺線蟲(*Trichodorus sparsus*)與體外寄生蟲毛刺線蟲屬(*Trichodorus* spp.)、農田矮化線蟲(*Tylenchorhynchus agri*)、菜蔬矮化線蟲(*Tylenchorhynchus brassicae*)、清亮矮化線蟲(*Tylenchorhynchus clarus*)、克萊頓矮化線蟲(*Tylenchorhynchus claytoni*)、指狀矮化線蟲(*Tylenchorhynchus digitatus*)、伊布里矮化線蟲(*Tylenchorhynchus ebriensis*)、最大矮化線蟲(*Tylenchorhynchus maximus*)、裸矮化線蟲(*Tylenchorhynchus nudus*)、普通矮化線蟲(*Tylenchorhynchus vulgaris*)與矮化線蟲屬(*Tylenchorhynchus* spp.)、柑橘半穿刺線蟲(*Tylenchulus semipenetrans*)與半寄生蟲半穿刺線蟲屬(*Tylenchulus* spp.)、美洲劍線蟲(*Xiphinema americanum*)、短頸劍線蟲(*Xiphinema brevicolle*)、裂尾劍線蟲(*Xiphinema dimorphicaudatum*)、標準劍線蟲(*Xiphinema index*)與體外寄生蟲劍線蟲屬(*Xiphinema* spp.)。

【0180】可使用式(I)化合物防治的線蟲包括根瘤線蟲屬(*Meloidogyne*)之線蟲，如南方根瘤線蟲(南方根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*))、爪哇根瘤線蟲(爪哇根瘤線蟲(*Meloidogyne javanica*))、北方根瘤線蟲(北方根瘤線蟲(*Meloidogyne*

hapla))、及花生根瘤線蟲(花生根瘤線蟲(*Meloidogyne arenaria*))；莖線蟲屬(*Ditylenchus*)之線蟲，如馬鈴薯腐敗線蟲(*Ditylenchus destructor*)及莖與球莖線蟲(莖線蟲(*Ditylenchus dipsaci*))；短體線蟲屬(*Pratylenchus*)之線蟲，如穗軸根腐線蟲(穿刺短體線蟲(*Pratylenchus penetrans*))、菊花根腐線蟲(菊花短體線蟲(*Pratylenchus fallax*))、咖啡根線蟲(咖啡短體線蟲(*Pratylenchus coffeae*))、茶樹根線蟲(盧斯短體線蟲(*Pratylenchus loosi*))與胡桃根腐線蟲(傷殘短體線蟲(*Pratylenchus vulnus*))；黃金線蟲屬(*Globodera*)之線蟲，如黃色馬鈴薯包囊線蟲(馬鈴薯黃金線蟲(*Globodera rostochiensis*))與白色馬鈴薯包囊線蟲(馬鈴薯包囊線蟲(*Globodera pallida*))；包囊線蟲屬(*Heterodera*)之線蟲，如大豆包囊線蟲(*Heterodera glycines*)與甜菜包囊線蟲(甜菜孢囊線蟲(*Heterodera schachtii*))；滑刃線蟲屬(*Aphelenchoides*)之線蟲，如稻白尖病線蟲(葉芽滑刃線蟲(*Aphelenchoides besseyi*))、菊花線蟲(菊花滑刃線蟲(*Aphelenchoides ritzemabosi*))與草莓線蟲(草莓滑刃線蟲(*Aphelenchoides fragariae*))；真滑刃線蟲屬(*Aphelenchus*)之線蟲，如食真菌性線蟲(燕麥真滑刃線蟲(*Aphelenchus avenae*))；穿孔線蟲屬(*Radopholus*)之線蟲，如穿孔線蟲(香蕉穿孔線蟲(*Radopholus similis*))；半穿刺線蟲屬(*Tylenchulus*)之線蟲，如柑橘根線蟲(柑橘半穿刺線蟲(*Tylenchulus semipenetrans*))；腎狀線蟲屬(*Rotylenchulus*)之線蟲，如腎形線蟲(腎形腎狀線蟲(*Rotylenchulus reniformis*))；鑽木線蟲，如松材線蟲(*Bursaphelenchus xylophilus*)與椰子傘滑刃線蟲(*Bursaphelenchus cocophilus*))、及其類似物。

【0181】可使用式(I)化合物保護的植物包括諸如，穀類(如水稻、大麥、小麥、黑麥、燕麥、玉米、及其類似物)、豆類(大豆、紅豆、豆類、蠶豆、豌豆、花生、及其類似物)、果樹/果實(蘋果、柑橘品種、梨、藤步、桃、日本杏、櫻桃、胡桃、扁桃、香蕉、草莓、及其類似物)、蔬菜品種(大白菜、番茄、菠菜、青花菜、萵苣、洋蔥、蔥、胡椒、及其類似物)、根部作物(胡蘿蔔、馬鈴薯、地瓜、蘿蔔、蓮藕、大頭菜、及其類似物)、用於工業原料的植物(棉花、麻、構樹、三

桤樹、油菜、甜菜、啤酒花、甘蔗、甜菜、橄欖、橡膠、棕櫚樹、咖啡、菸草、茶葉、及其類似物)、瓜類(南瓜、小黃瓜、西瓜、香瓜、及其類似物)、草原植物(鴨茅、高粱、貓尾草、三葉草、苜蓿草、及其類似物)、草皮(臺北草、康穗草、及其類似物)、香料植物等(薰衣草、迷迭香、百里香、巴西利、胡椒、薑、及其類似物)、及花卉(菊花、玫瑰、蘭花、及其類似物)。

【0182】式(I)化合物特別適於防治咖啡線蟲，特別是短尾短體線蟲(*Pratylenchus brachyurus*)、咖啡短體線蟲(*Pratylenchus coffeae*)、短小根瘤線蟲(*Meloidogyne exigua*)、南方根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*)、咖啡瘤線線蟲(*Meloidogyne coffeicola*)、螺旋線蟲屬(*Helicotylenchus* spp.)以及咖啡根瘤線蟲(*Meloidogyne paranaensis*)、盤旋線蟲屬(*Rotylenchus* spp.)、劍線蟲屬(*Xiphinema* spp.)、矮化線蟲屬(*Tylenchorhynchus* spp.)、盾線蟲屬(*Scutellonema* spp.)。

【0183】式(I)化合物特別適於防治馬鈴薯線蟲，特別是短尾短體線蟲(*Pratylenchus brachyurus*)、草地短體線蟲(*Pratylenchus pratensis*)、斯克里布納短體線蟲(*Pratylenchus scribneri*)、穿刺短體線蟲(*Pratylenchus penetrans*)、咖啡短體線蟲(*Pratylenchus coffeae*)、莖線蟲(*Ditylenchus dipsaci*)與亞倫氏短體線蟲(*Pratylenchus alleni*)、安地斯短體線蟲(*Pratylenchus andinus*)、小麥短體線蟲(*Pratylenchus cerealis*)、刻痕短體線蟲(*Pratylenchus crenatus*)、六裂短體線蟲(*Pratylenchus hexincisus*)、盧斯短體線蟲(*Pratylenchus loosi*)、落選短體線蟲(*Pratylenchus neglectus*)、大麥短體線蟲(*Pratylenchus teres*)、索氏短體線蟲(*Pratylenchus thornei*)、傷殘短體線蟲(*Pratylenchus vulnus*)、長尾刺線蟲(*Belonolaimus longicaudatus*)、圓桶毛刺線蟲(*Trichodorus cylindricus*)、原始毛刺線蟲(*Trichodorus primitivus*)、普希毛刺線蟲(*Trichodorus proximus*)、相似毛刺線蟲(*Trichodorus similis*)、大蒜毛刺線蟲(*Trichodorus sparsus*)、小擬毛刺線蟲(*Paratrachodorus minor*)、蔥擬毛刺線蟲(*Paratrachodorus allius*)、短小擬毛刺線蟲(*Paratrachodorus nanus*)、光滑擬毛刺線蟲(*Paratrachodorus teres*)、花生根瘤線蟲

(*Meloidogyne arenaria*)、偽根瘤線蟲(*Meloidogyne fallax*)、北方根瘤線蟲(*Meloidogyne hapla*)、泰晤士根瘤線蟲(*Meloidogyne thamesi*)、南方根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*)、奇氏根瘤線蟲(*Meloidogyne chitwoodi*)、爪哇根瘤線蟲(*Meloidogyne javanica*)、假根瘤線蟲(*Nacobbus aberrans*)、馬鈴薯黃金線蟲(*Globodera rostochiensis*)、馬鈴薯包囊線蟲(*Globodera pallida*)、馬鈴薯腐敗線蟲(*Ditylenchus destructor*)、香蕉穿孔線蟲(*Radopholus similis*)、腎形線蟲(*Rotylenchulus reniformis*)、擬莖線蟲(*Neotylenchus vigissi*)、假牆草擬滑刃線蟲(*Paraphelenchus pseudoparietinus*)、草莓滑刃線蟲(*Aphelenchoides fragariae*)、及瓢線蟲屬(*Meloinema* spp.)。

【0184】式(I)化合物特別適於防治蕃茄線蟲，特別是花生根瘤線蟲(*Meloidogyne arenaria*)、北方根瘤線蟲(*Meloidogyne hapla*)、爪哇根瘤線蟲(*Meloidogyne javanica*)、南方根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*)、穿刺短體線蟲(*Pratylenchus penetrans*)以及尾短體線蟲(*Pratylenchus brachyurus*)、咖啡短體線蟲(*Pratylenchus coffeae*)、斯克里布納短體線蟲(*Pratylenchus scribneri*)、傷殘短體線蟲(*Pratylenchus vulnus*)、小擬毛刺線蟲(*Paratrichodorus minor*)、短小根瘤線蟲(*Meloidogyne exigua*)、假根瘤線蟲(*Nacobbus aberrans*)、枯萎黃金線蟲(*Globodera solanacearum*)、異頭錐線蟲(*Dolichodorus heterocephalus*)、及腎形線蟲(*Rotylenchulus reniformis*)。

【0185】式(I)化合物特別適於防治黃瓜線蟲，特別是花生根瘤線蟲(*Meloidogyne arenaria*)、北方根瘤線蟲(*Meloidogyne hapla*)、爪哇根瘤線蟲(*Meloidogyne javanica*)、南方根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*)、腎形線蟲(*Rotylenchulus reniformis*)、及索氏短體線蟲(*Pratylenchus thornei*)。

【0186】式(I)化合物特別適於防治棉花線蟲，特別是長尾刺線蟲(*Belonolaimus longicaudatus*)、南方根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*)、哥倫布紐帶線蟲(*Hoplolaimus columbus*)、帽狀紐帶線蟲(*Hoplolaimus galeatus*)、及腎形線

蟲(*Rotylenchulus reniformis*)。

【0187】式(I)化合物特別適於防治玉米線蟲，特別是長尾刺線蟲(*Belonolaimus longicaudatus*)、小短體線蟲(*Paratrichodorus minor*)以及短尾短體線蟲(*Pratylenchus brachyurus*)、德氏短體線蟲(*Pratylenchus delattrei*)、六裂短體線蟲(*Pratylenchus hexincisus*)、穿刺短體線蟲(*Pratylenchus penetrans*)、玉米短體線蟲(*Pratylenchus zeae*)、細小刺線蟲(*Belonolaimus gracilis*)、諾頓刺線蟲(*Belonolaimus nortoni*)、短環長針線蟲(*Longidorus breviannulatus*)、花生根瘤線蟲(*Meloidogyne arenaria*)、花生根瘤線蟲湯氏亞種(花生根瘤線蟲湯氏亞種(*Meloidogyne arenaria thamesi*))、禾本科根瘤線蟲(*Meloidogyne graminis*)、南方根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*)、南方根瘤線蟲亞力塔亞種(*Meloidogyne incognita acrita*)、爪哇根瘤線蟲(*Meloidogyne javanica*)、納西根瘤線蟲(*Meloidogyne naasi*)、禾谷包囊線蟲(*Heterodera avenae*)、稻包囊線蟲(*Heterodera oryzae*)、玉米包囊線蟲(*Heterodera zeae*)、墨西哥玉米胞囊線蟲(*Punctodera chalcoensis*)、莖線蟲(*Ditylenchus dipsaci*)、埃及紐帶線蟲(*Hoplolaimus aegyptii*)、大針紐帶線蟲(*Hoplolaimus magnistylus*)、帽狀紐帶線蟲(*Hoplolaimus galeatus*)、印度紐帶線蟲(*Hoplolaimus indicus*)、雙角螺旋線蟲(*Helicotylenchus digonicus*)、雙宮螺旋線蟲(*Helicotylenchus dihystra*)、假強壯螺旋線蟲(*Helicotylenchus pseudorobustus*)、美洲劍線蟲(*Xiphinema americanum*)、異頭錐線蟲(*Dolichodorus heterocephalus*)、裝飾小環線蟲(*Criconemella ornata*)、刻線小環線蟲(*Criconemella onoensis*)、香蕉穿孔線蟲(*Radopholus similis*)、北方貝腎狀線蟲(*Rotylenchulus borealis*)、微小腎狀線蟲(*Rotylenchulus parvus*)、農田矮化線蟲(*Tylenchorhynchus agri*)、清亮矮化線蟲(*Tylenchorhynchus clarus*)、克萊頓矮化線蟲(*Tylenchorhynchus claytoni*)、最大矮化線蟲(*Tylenchorhynchus maximus*)、裸矮化線蟲(*Tylenchorhynchus nudus*)、普通矮化線蟲(*Tylenchorhynchus vulgaris*)、銳利五溝線蟲(*Quinisulcius acutus*)、微小針線蟲(*Paratylenchus minutus*)、塔堅鞘線蟲(*Hemicycliophora parvana*)、居農野外

墊刃線蟲(*Aglenchus agricola*)、小麥粒癭線蟲(*Anguina tritici*)、花生滑刃線蟲(*Aphelenchoides arachidis*)、小尾盾線蟲(*Scutellonema brachyurum*)、及亞粒線蟲(*Subanguina radiciola*)。

【0188】式(I)化合物特別適於防治大豆線蟲，特別是短尾短體線蟲(*Pratylenchus brachyurus*)、草地短體線蟲(*Pratylenchus pratensis*)、穿刺短體線蟲(*Pratylenchus penetrans*)、斯克里布納短體線蟲(*Pratylenchus scribneri*)、長尾刺線蟲(*Belonolaimus longicaudatus*)、大豆包囊線蟲(*Heterodera glycines*)、哥倫布紐帶線蟲(*Hoplolaimus columbus*)以及咖啡短體線蟲(*Pratylenchus coffeae*)、六裂短體線蟲(*Pratylenchus hexincisus*)、落選短體線蟲(*Pratylenchus neglectus*)、刻痕短體線蟲(*Pratylenchus crenatus*)、亞倫氏短體線蟲(*Pratylenchus allenii*)、敏捷短體線蟲(*Pratylenchus agilis*)、玉米短體線蟲(*Pratylenchus zaeae*)、傷殘短體線蟲(*Pratylenchus vulnus*)、細小刺線蟲(*Belonolaimus gracilis*)、花生根瘤線蟲(*Meloidogyne arenaria*)、南方根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*)、爪哇根瘤線蟲(*Meloidogyne javanica*)、北方根瘤線蟲(*Meloidogyne hapla*)、哥倫布紐帶線蟲(*Hoplolaimus columbus*)、帽狀紐帶線蟲(*Hoplolaimus galeatus*)、及腎形線蟲(*Rotylenchulus reniformis*)。

【0189】式(I)化合物特別適於防治菸草線蟲，特別是南方根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*)、爪哇根瘤線蟲(*Meloidogyne javanica*)以及短尾短體線蟲(*Pratylenchus brachyurus*)、草地短體線蟲(*Pratylenchus pratensis*)、六裂短體線蟲(*Pratylenchus hexincisus*)、穿刺短體線蟲(*Pratylenchus penetrans*)、落選短體線蟲(*Pratylenchus neglectus*)、刻痕短體線蟲(*Pratylenchus crenatus*)、索氏短體線蟲(*Pratylenchus thornei*)、傷殘短體線蟲(*Pratylenchus vulnus*)、玉米短體線蟲(*Pratylenchus zaeae*)、橫帶長針線蟲(*Longidorus elongatus*)、擬毛刺線蟲(*Paratrichodorus lobatus*)、毛刺線蟲屬(*Trichodorus* spp.)、花生根瘤線蟲(*Meloidogyne arenaria*)、北方根瘤線蟲(*Meloidogyne hapla*)、菸草黃金線蟲

(*Globodera tabacum*)、枯萎黃金線蟲(*Globodera solanacearum*)、維吉尼亞黃金線蟲(*Globodera virginiae*)、莖線蟲(*Ditylenchus dipsaci*)、盤旋線蟲屬(*Rotylenchus* spp.)、螺旋線蟲屬(*Helicotylenchus* spp.)、美洲劍線蟲(*Xiphinema americanum*)、環紋線蟲屬(*Criconemella* spp.)、腎形線蟲(*Rotylenchulus reniformis*)、克萊頓矮化線蟲(*Tylenchorhynchus claytoni*)、針線蟲屬(*Paratylenchus* spp.)、及菸鹼頭線蟲(*Tetylenchus nicotianae*)。

【0190】式(I)化合物特別適於防治柑橘線蟲，特別是咖啡短體線蟲(*Pratylenchus coffeae*)以及短尾短體線蟲(*Pratylenchus brachyurus*)、傷殘短體線蟲(*Pratylenchus vulnus*)、長尾刺線蟲(*Belonolaimus longicaudatus*)、小擬毛刺線蟲(*Paratrichodorus minor*)、胼胝擬毛刺線蟲(*Paratrichodorus porosus*)、毛刺線蟲(*Trichodorus*)、南方根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*)、南方根瘤線蟲亞力塔亞種(*Meloidogyne incognita acrita*)、爪哇根瘤線蟲(*Meloidogyne javanica*)、大囊盤旋線蟲(*Rotylenchus macrodorus*)、美洲劍線蟲(*Xiphinema americanum*)、短頸劍線蟲劍線蟲(*Xiphinema brevicolle*)、標準劍線蟲(*Xiphinema index*)、環紋線蟲屬(*Criconemella* spp.)、半鞘線蟲(*Hemicriconemoides*)、香蕉穿孔線蟲(*Radopholus similis*)與柑橘穿孔線蟲(*Radopholus citrophilus*)、花生鞘線蟲(*Hemicycliophora arenaria*)、裸出鞘線蟲(*Hemicycliophora nudata*)、及柑橘半穿刺線蟲(*Tylenchulus semipenetrans*)。

【0191】式(I)化合物特別適於防治香蕉線蟲，特別是咖啡短體線蟲(*Pratylenchus coffeae*)、香蕉穿孔線蟲(*Radopholus similis*)以及吉伯氏短體線蟲(*Pratylenchus giibbicaudatus*)、盧斯短體線蟲(*Pratylenchus loosi*)、根瘤線蟲屬(*Meloidogyne* spp.)、多帶螺旋線蟲(*Helicotylenchus multicinctus*)、雙宮螺旋線蟲(*Helicotylenchus dihystra*)、及腎狀線蟲屬(*Rotylenchulus* spp.)。

【0192】式(I)化合物特別適於防治鳳梨線蟲，特別是玉米短體線蟲(*Pratylenchus zeae*)、草地短體線蟲(*Pratylenchus pratensis*)、短尾短體線蟲

(*Pratylenchus brachyurus*)、古迪氏短體線蟲(*Pratylenchus goodeyi*)、根瘤線蟲屬(*Meloidogyne* spp.)、腎形線蟲(*Rotylenchulus reniformis*)以及橫帶長針線蟲(*Longidorus elongatus*)、禿頂長針線蟲(*Longidorus laevicapitatus*)、原始毛刺線蟲(*Trichodorus primitivus*)、微小毛刺線蟲(*Trichodorus minor*)、包囊線蟲屬(*Heterodera* spp.)、蘑菇莖線蟲(*Ditylenchus myceliophagus*)、加州紐帶線蟲(*Hoplolaimus californicus*)、擬強壯紐帶線蟲(*Hoplolaimus pararobustus*)、印度紐帶線蟲(*Hoplolaimus indicus*)、雙宮螺旋線蟲(*Helicotylenchus dihystra*)、矮小螺旋線蟲(*Helicotylenchus nannus*)、多帶螺旋線蟲(*Helicotylenchus multicinctus*)、赤色螺旋線蟲(*Helicotylenchus erythrinus*)、裂尾劍線蟲(*Xiphinema dimorphicaudatum*)、香蕉穿孔線蟲(*Radopholus similis*)、指狀矮化線蟲(*Tylenchorhynchus digitatus*)、伊布里矮化線蟲(*Tylenchorhynchus ebriensis*)、微小針線蟲(*Paratylenchus minutus*)、卡維內斯螺旋線蟲(*Scutellonema clathricaudatum*)、山藥螺旋線蟲(*Scutellonema bradys*)、膨大平滑墊刃線蟲(*Psilenchus tumidus*)、平滑墊刃線蟲(*Psilenchus magnidens*)、微小假海矛線蟲(*Pseudohalenchus minutus*)、弗尼亞輪線蟲(*Criconemoides ferniae*)、歐諾輪線蟲(*Criconemoides onoense*)、及飾頂輪線蟲(*Criconemoides ornatum*)。

【0193】式(I)化合物特別適於防治藤步線蟲，特別是傷殘短體線蟲(*Pratylenchus vulnus*)、花生根瘤線蟲(*Meloidogyne arenaria*)、南方根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*)、爪哇根瘤線蟲(*Meloidogyne javanica*)、美洲劍線蟲(*Xiphinema americanum*)、標準劍線蟲(*Xiphinema index*)以及草地短體線蟲(*Pratylenchus pratensis*)、斯克里布納短體線蟲(*Pratylenchus scribneri*)、落選短體線蟲(*Pratylenchus neglectus*)、短尾短體線蟲(*Pratylenchus brachyurus*)、索氏短體線蟲(*Pratylenchus thornei*)、及柑橘半穿刺線蟲(*Tylenchulus semipenetrans*)。

【0194】式(I)化合物特別適於防治在樹類作物-梨果中的線蟲，特別是穿刺短體線蟲(*Pratylenchus penetrans*)以及傷殘短體線蟲(*Pratylenchus vulnus*)、橫帶長

針線蟲(*Longidorus elongatus*)、南方根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*)、及北方根瘤線蟲(*Meloidogyne hapla*)。

【0195】 式(I)化合物特別適於防治在樹類作物-核果中的線蟲，特別是穿刺短體線蟲(*Pratylenchus penetrans*)、傷殘短體線蟲(*Pratylenchus vulnus*)、花生根瘤線蟲(*Meloidogyne arenaria*)、北方根瘤線蟲(*Meloidogyne hapla*)、爪哇根瘤線蟲(*Meloidogyne javanica*)、南方根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*)、薄葉小環線蟲(*Criconemella xenoplax*)與短尾短體線蟲(*Pratylenchus brachyurus*)、咖啡短體線蟲(*Pratylenchus coffeae*)、斯克里布納短體線蟲(*Pratylenchus scribneri*)、玉米短體線蟲(*Pratylenchus zeae*)、長尾刺線蟲(*Belonolaimus longicaudatus*)、雙宮螺旋線蟲(*Helicotylenchus dihystra*)、美洲劍線蟲(*Xiphinema americanum*)、彎曲小環線蟲(*Criconemella curvata*)、克萊頓矮化線蟲(*Tylenchorhynchus claytoni*)、鉤針線蟲(*Paratylenchus hamatus*)、突出針線蟲(*Paratylenchus projectus*)、小尾盾線蟲(*Scutellonema brachyurum*)、及帽狀紐帶線蟲(*Hoplolaimus galeatus*)。

【0196】 式(I)化合物特別適於防治在樹類作物-甘蔗及稻米中的線蟲，特別是毛刺線蟲屬(*Trichodorus* spp.)、環紋線蟲屬(*Criconemella* spp.)以及短體線蟲屬(*Pratylenchus* spp.)、擬毛刺線蟲屬(*Paratrachodorus* spp.)、根瘤線蟲屬(*Meloidogyne* spp.)、螺旋線蟲屬(*Helicotylenchus* spp.)、矮化線蟲屬(*Tylenchorhynchus* spp.)、滑刃線蟲屬(*Aphelenchoides* spp.)、包囊線蟲屬(*Heterodera* spp.)、劍線蟲屬(*Xiphinema* spp.)、及瘟疫壞死線蟲(*Cacopaurus pestis*)。

施用

【0197】 式(I)化合物可直接施加，或諸如以即用型溶液、乳劑、水基與油基懸浮液、粉劑、可濕性粉劑、糊劑、可溶性粉劑、粉末、可溶性顆粒、用於撒播之顆粒、懸浮乳劑濃縮物、以式(I)化合物浸漬之天然產物、以式(I)化合物浸漬之合成物質、肥料、或聚合物質之微膠囊的形式施加。

【0198】 施加係以常規方式完成，如藉由澆水、噴灑、霧化、撒播、撒粉、

起泡、鋪展、及其類似方式。亦可藉由超低體積法，經由滴灌系統或淋水施加，部署式(I)化合物，進行槽溝施加或注入土壤莖或樹幹中。亦可利用傷口密封、塗料、或其他傷口敷料施加式(I)化合物。

【0199】 式(I)化合物施加至植物、植物部位、果實、種子，或土壤之有效及植物兼容量取決於各種因素，如所用之化合物/組合物、處理對象(植物、植物部位、果實、種子、或土壤)、處理類型(除塵、噴灑、拌種)、處理目的(治療性與保護性)、微生物類型、微生物之發育階段、微生物之敏感性、作物生長階段、及環境條件。

【0200】 當式(I)化合物作為殺真菌劑時，施加率可在相對廣的範圍內變化，取決於施加的種類。針對植物部位(如葉子)的處理，施加率的範圍可為0.1至10 000 g/ha，較佳地10至1000 g/ha，更佳地50至300 g/ha (在藉由澆水或滴水施加之情況下，甚至可降低施加率，特別是在使用惰性基質如岩棉或珍珠岩時)。針對種子的處理，施加率的範圍可為每100 kg之種子0.1至200 g，較佳地每100 kg之種子1至150 g，更佳地每100 kg之種子2.5至25 g，甚而更佳地每100 kg之種子2.5至12.5 g。針對土壤的處理，施加率的範圍可為0.1至10 000 g/ha，較佳地1至5000 g/ha。

【0201】 彼等施加率僅為實例，且未旨在侷限本發明之範疇。

材料保護

【0202】 本發明之化合物與組成物亦可用於保護材料，特別是用於保護工業材料抵禦不需要之微生物的侵襲與破壞。

【0203】 此外，本發明之化合物與組成物可作為防污組成物，單獨使用或與其他活性成分組合使用。

【0204】 本文之工業材料應理解為意指已準備用於工業的無生命材料。舉例而言，用於保護免於微生物改變或破壞的工業材料可為黏著劑、膠水、紙、壁紙與紙板/卡紙板、紡織品、地毯、皮革、木材、纖維與薄紙、塗料與塑料製品、

冷卻潤滑劑、及其他可被微生物感染或破壞的材料。生產廠房與建築物的部件，如冷卻水迴路、冷卻與加熱系統、及通風與空調單元，可能會因微生物的繁殖而受到損害，亦應在欲保護之材料範疇內提及。本發明範疇內之工業材料較佳地包括黏著劑、膠料、紙張與卡片、皮革、木材、塗料、冷卻潤滑劑、及傳熱流體，更佳地木材。

【0205】 本發明之化合物與組成物可防止諸如腐朽、腐爛、變色、脫色、或黴菌形成等不良影響。

【0206】 在木材之處理的情況中，本發明之化合物與組成物亦可用於抵禦易於在木材上或木材內部生長的真菌性病害。

【0207】 木材意指所有種類的木材，以及旨在用於建築之此木材的所有類型作業，如實木、高密度木材、層壓木材、及膠合板。此外，本發明之化合物與組成物可用於保護與鹽水或微鹹水接觸的物體(尤其是船體、篩網、網、建築物、繫泊設備、及信號系統)免於污染。

【0208】 本發明之化合物與組成物亦可用於保護貯藏品。貯藏品應理解為意指植物源或動物源之天然物質或其加工品(天然來源)，需要對其進行長期保護。植物源(如植物或植物部位)之貯藏品，如莖、葉、塊莖、種子、果實、穀物，可藉由(預)乾燥、潤濕、粉碎、磨碎、壓榨、或焙烤來保護新鮮收成或加工後的產品。貯藏品亦包括未加工木材(如建築木材)、電線桿與柵欄、或成品形式(如傢俱)。動物源之貯藏品諸如生皮、皮革、毛皮、及毛髮。本發明之化合物與組成物可防止不良影響，如腐朽、腐爛、變色、脫色、或黴菌形成。

【0209】 能分解或改變工業材料之微生物包括例如，細菌、真菌、酵母、藻類、及黏液生物。本發明之化合物與組成物較佳地可抵禦真菌，尤其是黴菌、木材變色、及破壞木材之真菌(子囊菌綱(*Ascomycetes*)、擔子菌綱(*Basidiomycetes*)、不完全菌綱(*Deuteromycetes*)、及接合菌綱(*Zygomycetes*))，以及抵禦黏液生物與藻類。實施例包括以下各屬之微生物：鏈隔孢菌屬(*Alternaria*)，

如互生鏈隔孢菌(*Alternaria tenuis*)；麴菌屬(*Aspergillus*)，如黑麴菌(*Aspergillus niger*)；毛殼菌屬(*Chaetomium*)，如球毛殼菌(*Chaetomium globosum*)；粉孢革菌屬(*Coniophora*)，如單純粉孢革菌(*Coniophora puetana*)；香菇屬(*Lentinus*)，如虎皮香菇(*Lentinus tigrinus*)；青黴菌屬(*Penicillium*)，如(*Penicillium glaucum*)；多孔菌屬(*Polyporus*)，如雜色多孔菌(*Polyporus versicolor*)；擔子菌屬(*Aureobasidium*)，如暗金黃擔子菌；硬皮莖點黴屬(*Sclerophoma*)，如綠木黴(*Sclerophoma pityophila*)；木黴屬(*Trichoderma*)，如綠木黴菌；長喙殼屬(*Ophiostoma spp.*)、長喙殼屬(*Ceratocystis spp.*)、腐質黴屬(*Humicola spp.*)、彼德殼屬(*Petriella spp.*)、毛束黴屬(*Trichurus spp.*)、革蓋束菌屬(*Coriolus spp.*)、黏褶菌屬(*Gloeophyllum spp.*)、側耳屬(*Pleurotus spp.*)、臥孔屬(*Poria spp.*)、色孢皺孔菌屬(*Serpula spp.*)與乾酪菌屬(*Tyromyces spp.*)、枝孢屬(*Cladosporium spp.*)、擬青黴屬(*Paecilomyces spp.*)、毛黴屬(*Mucor spp.*)、大腸桿菌屬(*Escherichia*)，如大腸桿菌(*Escherichia coli*)；假單胞菌屬(*Pseudomonas*)，如綠膿桿菌(*Pseudomonas aeruginosa*)；葡萄球菌屬(*Staphylococcus*)，如金黃色葡萄球菌(*Staphylococcus aureus*)、念珠菌屬(*Candida spp.*)、及酵母菌屬(*Saccharomyces spp.*)，如釀酒酵母(*Saccharomyces cerevisiae*)。

實施例

式(I)化合物之合成

製備例1：5-(4,5-二溴-3-氟-2-噻吩基)-6-噻-4-氮雜螺[2.4]庚-4-烯-7-酮(化合物I.03)之製備

步驟1：1-[(4,5-二溴-3-氟-2-噻吩基)羰基]胺基}環丙烷羧酸甲酯之製備

【0210】 在惰性環境下之100 mL圓底燒瓶中，將溶於4.3 mL二氯甲烷之733 mg (4.33 mmol) 2-氯-1,3-二甲基咪唑氯化物的溶液添加至溶於35 mL二氯甲烷之1.0 g (3.33 mmol) 4,5-二溴-3-氟噻吩-2-羧酸與2.50 mL (14.3 mmol) *N,N*-二異丙基乙胺的溶液中。在攪拌15分鐘後，添加1.0 g (6.66 mmol)之1-胺基環丙烷羧酸甲酯鹽酸鹽(1:1)，且反應混合物在室溫下攪拌72小時。添加水，且所得反應

混合物以二氯甲烷萃取兩次。合併的有機層藉由Chem Elut™匣過濾，並在減壓下濃縮。殘餘物藉由矽膠管柱層析法純化(梯度為二氯甲烷/乙酸乙酯)，以得1.24 g (100%純度，93%產率)的標題化合物，其為白色固體。LogP = 2.77。(M+H) = 400。

步驟2：1-[[[(4,5-二溴-3-氟-2-噻吩基)羰硫基]胺基]環丙烷羧酸甲酯之製備

【0211】 將267 mg (0.66 mmol)之勞森試劑添加至含有265 mg (0.65 mmol) 甲基 1-[[[(4,5-二溴-3-氟-2-噻吩基)羰基]胺基]環丙烷羧酸酯之5 mL 1,2-二甲氧基乙烷溶液中。反應混合物在50 °C下攪拌42小時。所得反應混合物以二氯甲烷稀釋，並藉由基礎Chromabond® Alumina匣過濾，且在減壓下濃縮。殘餘物藉由矽膠管柱層析法純化(梯度為正庚烷/乙酸乙酯)，以得158 mg (100%純度，57%產率)的標題化合物，其為黃色固體。LogP = 3.91。(M+H) = 416。

步驟3：1-[[[(4,5-二溴-3-氟-2-噻吩基)羰硫基]胺基]環丙烷羧酸之製備

【0212】 將203 mg (0.47 mmol)之三甲基氫氧化錫添加至含有271 mg (0.47 mmol) 1-[[[(4,5-二溴-3-氟-2-噻吩基)羰硫基]胺基]環丙烷羧酸甲酯之7 mL 1,2-二氯乙烷溶液中。反應混合物在60 °C下攪拌18小時。所得反應混合物在減壓下濃縮，溶於乙酸乙酯中，並以1.0 M鹽酸水溶液清洗三次。合併的有機層藉由Chem Elut™匣過濾，並在減壓下濃縮。殘留物藉由製備型高效能液相層析法純化(梯度為乙腈/甲酸水溶液(1%))，以得135 mg (100%純度，54%產率)的標題化合物，其為黃色固體。LogP = 2.95。(M+H) = 402。

步驟4：5-(4,5-二溴-3-氟-2-噻吩基)-6-噻-4-氮雜螺[2.4]庚-4-烯-7-酮(化合物I.03)之製備

【0213】 將43 mg (0.22 mmol)之1-(3-二甲基胺基丙基)-3-乙基碳二亞胺鹽酸鹽添加至含有70 mg (0.17 mmol) 1-[[[(4,5-二溴-3-氟-2-噻吩基)羰硫基]胺基]環丙烷羧酸之2 mL 二氯甲烷溶液中。反應混合物在室溫下攪拌18小時。添加水，且所得反應混合物以二氯甲烷萃取兩次。合併的有機層藉由Chem Elut™匣過濾，

並在減壓下濃縮。殘餘物藉由矽膠管柱層析法純化(梯度為正庚烷/乙酸乙酯)，以得51 mg (94%純度，72%產率)的標題化合物，其為淺粉紅色固體。 $\text{LogP} = 5.08$ 。 $(\text{M}+\text{H}) = 384$ 。

製備例2：3-溴-4-甲基-5-(7-側氧基-6-氧雜-4-氮雜螺[2.4]庚-4-烯-5-基)噻吩-2-腈(化合物I.06)之製備

步驟1：4-溴-5-氰基-3-甲基噻吩-2-羧酸之製備

【0214】將0.7 mL之1.1 M氫氧化鋰水溶液(0.7 mmol)滴加至含有150 mg (0.86 mmol) 4-溴-5-氰基-3-甲基噻吩-2-羧酸甲酯之3.9 mL四氫呋喃溶液中。反應混合物在室溫下攪拌1小時。所得反應混合物在0 °C下以1.0 M鹽酸水溶液小心地酸化，並以乙酸乙酯萃取。合併的有機層以無水硫酸鎂乾燥、過濾，並在減壓下濃縮，以得142 mg (97%純度，97%產率)的標題化合物，其為白色固體。 $\text{LogP} = 2.05$ 。 $(\text{M}+\text{H}) = 246$ 。

步驟2：1-[[[(4-溴-5-氰基-3-甲基-2-噻吩基)羰基]胺基]環丙烷羧酸甲酯]之製備

【0215】將溶於7.9 mL二氯甲烷之1.34 g (7.92 mmol) 2-氯-1,3-二甲基咪唑氯化物溶液添加至溶於50 mL二氯甲烷之1.50 mg (6.09 mmol) 4-溴-5-氰基-3-甲基噻吩-2-羧酸與4.57 mL (26.2 mmol) *N,N*-二異丙基乙胺的溶液中。在攪拌15分鐘後，添加1.85 g (12.1 mmol)之1-胺基環丙烷羧酸甲酯鹽酸鹽(1:1)，且反應混合物在室溫下攪拌72小時。添加水，且所得反應混合物以二氯甲烷萃取兩次。所得反應混合物在減壓下濃縮。殘餘物藉由矽膠管柱層析法純化(梯度為二氯甲烷/乙酸乙酯)，以得1.55 g (96%純度，71%產率)的標題化合物，其為白色固體。 $\text{LogP} = 2.31$ 。 $(\text{M}+\text{H}) = 343$ 。

步驟3：1-[[[(4-溴-5-氰基-3-甲基-2-噻吩基)羰基]胺基]環丙烷羧酸]之製備

【0216】將1.5 mL之1.0 M氫氧化鋰水溶液(0.7 mmol)滴加至含有400 mg (1.16 mmol) 1-[[[(4-溴-5-氰基-3-甲基-2-噻吩基)羰基]胺基]環丙烷羧酸甲酯]之8.0 mL四氫呋喃的溶液中。反應混合物在室溫下攪拌2小時。所得反應混合物在

0 °C下以1.0 M鹽酸水溶液小心地酸化為pH 1，並以乙酸乙酯萃取三次。合併的有機層藉由Chem Elut™匣過濾，並在減壓下濃縮。殘留物藉由製備型高效能液相層析法純化(梯度為乙腈/甲酸水溶液(1%))，以得301 mg (92%純度，72%產率)的標題化合物，其為白色固體。LogP = 1.88。(M+H) = 329。

步驟3之二：1-{[(4-溴-5-氰基-3-甲基-2-噻吩基)羰基]胺基}環丙烷羧酸之替代製備

【0217】在第一個圓底燒瓶中，在室溫下將47 µL (0.53 mmol)之草醯氯與一滴*N,N*-二甲基甲醯胺添加至含有120 mg (0.48 mmol) 4-溴-5-氰基-3-甲基噻吩-2-羧酸之4 mL乾燥二氯甲烷溶液。在室溫下攪拌45分鐘後，反應混合物在減壓下濃縮，並溶於2 mL之乾燥1,4-二噁烷中，以得醯基氯化物之溶液。在第二個圓底燒瓶中，將1.46 mL之1.0 M氫氧化鈉水溶液(1.46 mmol)添加至含有134 mg (0.97 mmol) 1-胺基環丙烷羧酸鹽酸鹽(1:1)之1 mL水的溶液中。反應混合物在室溫下攪拌30分鐘，隨後在0°C下緩慢添加至先前準備的醯基氯化物溶液中。所得反應混合物在室溫下攪拌24小時，以水稀釋，在0 °C下以1.0 M鹽酸水溶液小心地酸化為pH 1，並以乙酸乙酯萃取。合併的有機層藉由Chem Elut™匣過濾，並在減壓下濃縮。殘留物藉由製備型高效能液相層析法純化(梯度為乙腈/甲酸水溶液(1%))，以得65 mg (100%純度，41%產率)的標題化合物，其為白色固體。LogP = 1.84。(M+H) = 329。

步驟4：3-溴-4-甲基-5-(7-側氧基-6-氧雜-4-氮雜螺[2.4]庚-4-烯-5-基)噻吩-2-腈(化合物I.06)之製備

【0218】在惰性環境下之100 mL圓底燒瓶中，將溶於0.47 mL二氯甲烷之80 mg (0.47 mmol) 2-氯-1,3-二甲基咪唑氯化物溶液添加至溶於4 mL二氯甲烷之1.0 g (3.33 mmol) 1-{[(4-溴-5-氰基-3-甲基-2-噻吩基)羰基]胺基}環丙烷羧酸與0.19 mL (1.09 mmol) *N,N*-二異丙基乙胺的溶液中。反應混合物在室溫下攪拌18小時。添加水，且所得反應混合物以二氯甲烷萃取兩次。合併的有機層藉由

Chem Elut™ 匣過濾，並在減壓下濃縮。殘餘物藉由矽膠管柱層析法純化(梯度為正庚烷/乙酸乙酯)，以得87 mg (100%純度，77%產率)的標題化合物，其為白色固體。LogP = 3.37。 (M+H) = 311。

例示性化合物

【0219】 表1中所示之本發明例示性化合物係依據上面提供之實例及/或本文所揭示過程之一般描述並以類似方式製備。

【0220】 下表1以非侷限方式說明式(I)化合物之實例。

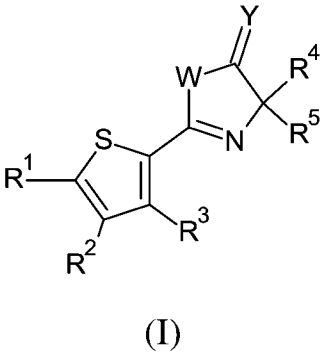


表1：

實施例 編號	R ¹	R ²	R ³	W	Y	R ⁴	R ⁵	LogP
I.01	Cl	Cl	Cl	S	O	-CH ₂ -CH ₂ -		5.61 ^[a]
I.02	Br	Br	CH ₃	S	O	-CH ₂ -CH ₂ -		5.65 ^[a]
I.03	Br	Br	F	S	O	-CH ₂ -CH ₂ -		5.08 ^[a]
I.04	Br	Br	Br	S	O	-CH ₂ -CH ₂ -		5.61 ^[a]
I.05	CN	Br	H	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -		2.83 ^[a]
I.06	CN	Br	CH ₃	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -		3.37 ^[a]
I.07	CN	Cl	CH ₃	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -		3.25 ^[a]
I.08	Cl	Br	Br	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -		4.12 ^[a]
I.09	Cl	Br	Cl	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -		4.01 ^[a]
I.10	Br	Br	CH ₃	O	O	H	丙烷-2-基	5.31 ^[a]

實施例 編號	R ¹	R ²	R ³	W	Y	R ⁴	R ⁵	LogP
I.11	Cl	Br	CH ₃	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -		4.39 ^[a]
I.12	Br	Cl	CH ₃	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -		4.32 ^[a]
I.13	Br	Br	F	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		4.02 ^[a]
I.14	Br	Br	I	S	O	-CH ₂ -CH ₂ -		5.61 ^[a]
I.15	Cl	Cl	CH ₃	S	O	-CH ₂ -CH ₂ -		5.53 ^[a]
I.16	Br	Br	F	O	O	CH ₃	CH ₃	3.77 ^[a]
I.17	Br	Br	Cl	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		4.51 ^[a]
I.18	Cl	Br	Br	O	O	CH ₃	CH ₃	4.32 ^[a]
I.19	Cl	Cl	CH ₃	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		4.75 ^[a]
I.20	Br	Br	Cl	O	O	CH ₃	CH ₃	4.26 ^[a]
I.21	Cl	Br	Cl	O	O	CH ₃	CH ₃	4.26 ^[a]
I.22	Cl	Cl	Br	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		4.55 ^[a]
I.23	Cl	Cl	Br	O	O	CH ₃	CH ₃	4.33 ^[a]
I.24	Cl	Cl	CH ₃	O	O	CH ₃	CH ₃	4.51 ^[a]
I.25	Cl	Br	Cl	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		4.47 ^[a]
I.26	CF ₃	Br	H	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -		3.98 ^[a]

在上表中，LogP值的測量係依據EEC指令79/831 Annex V.A8，利用HPLC (高效能液相層析法)在逆相管柱上進行，方法如下：

^[a] LogP值為藉由在酸性範圍內以0.1%甲酸水溶液與乙腈作為溶析液(線性梯度為10%乙腈至95%乙腈)測量LC-UV而確定。

^[b] LogP值為藉由在中性範圍內以0.001莫耳乙酸銨水溶液與乙腈作為溶析液(線性梯度為10%乙腈至95%乙腈)測量LC-UV而確定。

若在同一方法中可取得多個LogP值，則所有的值分別給予「+」。

以具有已知之LogP值的直鏈烷烴-2-酮(具有3至16個碳原子)進行校準(以保留時間對連續烷烴之間的線性內插法測量LogP值)。利用200 nm至400 nm之UV光譜與層析信號之尖峰值確定 $\lambda_{\max}$ 值。

NMR-尖峰列表

【0221】 表A提供上表揭示之一些化合物的NMR數據(^1H)。

【0222】 所選實例之 ^1H -NMR數據係以 ^1H -NMR尖峰列表形式列出。針對各個信號尖峰，列出了以ppm為單位的 δ 值，並在圓括號內列出了信號強度。在 δ 值-信號強度配對之間的分號係作為定界符。

【0223】 因此，一實例中之尖峰列表的形式為：

δ_1 (強度₁) ; δ_2 (強度₂) ; ; δ_i (強度_i) ; ; δ_n (強度_n)

【0224】 尖峰信號的強度與NMR光譜的圖像實例中的信號高度(以cm為單位)相關聯，並同時存在信號強度的真實關係。對於寬峰信號，可允許多個峰或中間信號，以及其相對於在光譜中最強信號的相對強度。

【0225】 為了校準 ^1H 光譜的化學位移，發明人使用四甲基矽烷及/或所用溶劑的化學位移，尤其是在DMSO中測量光譜的情況下。因此，在NMR尖峰列表中，可出現四甲基矽烷尖峰，但不是必需的。

【0226】 ^1H -NMR尖峰列表與經典的 ^1H -NMR譜圖相似，因此通常包含所有尖峰，其在經典NMR解釋中列出。

【0227】 此外，其可顯示出溶劑、目標化合物之立體異構體(其亦為本發明之目的)、及/或雜質尖峰的經典的 ^1H -NMR印跡信號。

【0228】 欲顯示在溶劑及/或水之 δ 範圍內的化合物信號，在 ^1H -NMR尖峰列表中顯示了溶劑通常的尖峰(如DMSO- D_6 中的DMSO尖峰與水的尖峰)，且通常具有平均高強度。

【0229】 目標化合物之立體異構物的尖峰及/或雜質的尖峰通常平均具有比目標化合物(如純度>90%)的尖峰更低的強度。

【0230】 此類立體異構物及/或雜質典型上用於特定製程。因此，其尖峰藉由「副產物-指紋」可協助識別製程再現性。

【0231】 可使用已知方法(MestreC, ACD模擬，亦可藉由經驗評估期望值)計算目標化合物的尖峰，並視需求任意地使用其他強度過濾器，分離出目標化合物的尖峰。此分離將類似於經典¹H-NMR解釋中的相關峰選擇。

【0232】 尖峰列表之NMR數據描述的更詳細訊息，可在Research Disclosure Disclosure Database Number 564025的出版品「 Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications 」中找到。

表A：NMR尖峰列表

I.01: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.2987 (10.8) ; 2.1192 (4.5) ; 2.1089 (4.4) ; 2.1021 (8.0) ; 2.0880 (16.0) ; 2.0759 (8.3) ; 2.0305 (1.9) ; 2.0261 (1.9) ; 1.9807 (8.4) ; 1.9686 (15.8) ; 1.9549 (8.0) ; 1.9477 (4.6) ; 1.9374 (4.6) ; 1.5961 (10.9) ; 1.3212 (0.5) ; 1.3136 (0.5) ; 1.2911 (0.9) ; 0.9182 (0.6) ; 0.1076 (0.6) ; 0.0474 (0.4) ; 0.0366 (14.4) ; 0.0257 (0.5)
I.02: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.2987 (2.4) ; 2.5653 (0.5) ; 2.5576 (16.0) ; 2.5471 (0.4) ; 2.1068 (1.0) ; 2.0962 (1.0) ; 2.0899 (1.8) ; 2.0759 (3.5) ; 2.0637 (1.7) ; 2.0145 (0.6) ; 1.9646 (1.7) ; 1.9526 (3.4) ; 1.9391 (1.8) ; 1.9322 (1.0) ; 1.9215 (1.0) ; 1.5968 (2.6) ; 0.0367 (3.2)
I.03: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.2984 (11.1) ; 2.0949 (3.4) ; 2.0843 (3.6) ; 2.0779 (6.5) ; 2.0639 (12.5) ; 2.0516 (6.1) ; 2.0032 (2.0) ; 1.9532 (6.4) ; 1.9411 (12.0) ; 1.9277 (6.5) ; 1.9206 (3.6) ; 1.9099 (3.5) ; 1.5956 (16.0) ; 1.3698 (0.5) ; 1.3211 (0.7) ; 1.3133 (0.4) ; 1.2911 (0.7) ; 0.9181 (0.4) ; 0.1082 (0.5) ; 0.0471 (0.5) ; 0.0363 (14.1) ; 0.0286 (0.4) ; 0.0271 (0.4) ; 0.0254 (0.5)
I.04: ¹ H-NMR(499.9 MHz, d ₆ -DMSO) : δ= 9.0012 (0.5) ; 5.7527 (1.2) ; 3.6195 (2.9) ; 3.3434 (7029.9) ; 3.1854 (1.0) ; 3.1720 (1.0) ; 3.1435 (0.8) ; 3.0976 (0.6) ; 3.0580 (0.5) ; 3.0245 (0.5) ; 3.0060 (0.5) ; 2.9645 (0.5) ; 2.9496 (0.4) ; 2.9251 (0.4) ; 2.8914 (0.4) ; 2.8463 (0.4) ; 2.8210 (0.4) ; 2.8076 (0.4) ; 2.7954 (0.4) ; 2.7650 (0.4) ; 2.7213 (0.5) ; 2.6389 (1.6) ; 2.5077 (155.0) ; 2.5043 (195.1) ; 2.5009 (142.7) ; 2.3653 (1.1) ; 2.2293 (0.4) ; 2.1611 (7.0) ; 2.1520 (14.1) ; 2.1429 (15.4) ; 2.1347 (6.2) ; 2.1038 (0.5) ; 2.0737 (0.8) ; 2.0268 (0.4) ; 2.0103 (0.5) ; 1.9972 (0.4) ; 1.9738 (0.6) ; 1.9468 (1.2) ; 1.9159 (8.2) ; 1.9076 (16.0) ; 1.8985 (13.2) ; 1.8895 (4.9) ; 1.4689 (0.7) ; 1.4590 (1.0) ; 1.4526 (1.0) ; 1.4431 (0.5) ; 1.4340 (0.5) ; 1.3532 (1.1) ; 1.3358 (1.9) ; 1.2995 (3.3) ; 1.2602 (5.1) ; 1.2368 (7.8) ; 1.1986 (0.6) ; 1.1900 (1.0) ; 1.1835 (0.8) ; 1.1731 (0.4) ; 0.8681 (0.8) ; 0.8553 (1.2) ; 0.8408 (0.7) ; 0.0671 (0.6)

I.05: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.6581 (0.3) ; 7.6429 (16.0) ; 7.2986 (6.1) ; 3.9720 (0.6) ; 2.0168 (2.9) ; 1.9955 (6.0) ; 1.9819 (9.6) ; 1.9714 (7.3) ; 1.9287 (7.0) ; 1.9183 (10.2) ; 1.9047 (6.2) ; 1.8834 (2.9) ; 1.6032 (2.0) ; 1.2900 (1.0) ; 0.9163 (0.3) ; 0.0348 (7.6)
I.06: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.2987 (0.8) ; 2.6251 (0.5) ; 2.6236 (0.6) ; 2.6221 (0.6) ; 2.6146 (16.0) ; 2.6070 (0.6) ; 2.0149 (0.8) ; 2.0110 (0.5) ; 1.9942 (2.0) ; 1.9819 (2.9) ; 1.9807 (3.2) ; 1.9697 (2.0) ; 1.9623 (0.9) ; 1.9265 (0.9) ; 1.9190 (2.1) ; 1.9082 (3.4) ; 1.8947 (2.0) ; 1.8777 (0.6) ; 1.8739 (0.8) ; 1.6284 (1.1) ; 0.0302 (1.0)
I.07: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.2986 (3.5) ; 2.5879 (16.0) ; 2.0182 (0.8) ; 2.0149 (0.5) ; 1.9974 (1.9) ; 1.9840 (3.1) ; 1.9731 (2.0) ; 1.9666 (0.9) ; 1.9303 (0.9) ; 1.9237 (2.0) ; 1.9129 (3.2) ; 1.8994 (2.0) ; 1.8819 (0.6) ; 1.8785 (0.8) ; 1.5983 (6.4) ; 0.0354 (4.4)
I.08: ¹ H-NMR(600.2 MHz, d ₆ -DMSO) : δ= 3.3795 (14.7) ; 2.5710 (4.2) ; 2.5680 (8.8) ; 2.5650 (12.0) ; 2.5620 (8.7) ; 2.5591 (4.0) ; 2.0232 (5.5) ; 2.0147 (14.0) ; 2.0078 (16.0) ; 2.0003 (6.7) ; 1.9739 (0.6) ; 1.8633 (0.6) ; 1.8370 (7.0) ; 1.8294 (15.7) ; 1.8225 (14.5) ; 1.8141 (5.5) ; 1.7890 (0.3)
I.09: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.2989 (7.8) ; 2.0077 (2.3) ; 1.9985 (2.1) ; 1.9878 (5.7) ; 1.9745 (8.8) ; 1.9626 (5.0) ; 1.9395 (1.6) ; 1.9145 (1.6) ; 1.8915 (5.3) ; 1.8796 (9.1) ; 1.8662 (5.9) ; 1.8556 (2.2) ; 1.8464 (2.5) ; 1.6004 (16.0) ; 1.2904 (0.6) ; 0.0362 (7.9)
I.10: ¹ H-NMR(499.9 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.2644 (1.2) ; 4.2425 (2.3) ; 4.2333 (2.3) ; 2.6108 (16.0) ; 2.5546 (2.4) ; 2.3741 (0.6) ; 2.3649 (0.8) ; 2.3604 (0.9) ; 2.3512 (0.9) ; 2.3468 (0.8) ; 2.3375 (0.7) ; 2.3331 (0.4) ; 1.1360 (7.8) ; 1.1223 (7.8) ; 1.0501 (0.9) ; 1.0364 (0.9) ; 1.0167 (1.0) ; 1.0079 (7.9) ; 1.0032 (1.7) ; 0.9942 (7.8) ; -0.0002 (1.2)
I.11: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.2985 (1.6) ; 2.5884 (16.0) ; 2.5570 (0.8) ; 1.9390 (0.9) ; 1.9351 (0.6) ; 1.9184 (2.1) ; 1.9052 (3.5) ; 1.8943 (2.2) ; 1.8870 (1.0) ; 1.8509 (1.0) ; 1.8436 (2.1) ; 1.8327 (3.5) ; 1.8195 (2.2) ; 1.8028 (0.6) ; 1.7990 (0.9) ; 1.2896 (0.6) ; 0.0355 (2.0)
I.12: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.2985 (3.3) ; 2.5985 (0.4) ; 2.5956 (0.5) ; 2.5880 (16.0) ; 1.9424 (0.8) ; 1.9379 (0.6) ; 1.9219 (2.1) ; 1.9087 (3.4) ; 1.8978 (2.1) ; 1.8893 (0.9) ; 1.8539 (0.9) ; 1.8454 (2.0) ; 1.8344 (3.5) ; 1.8212 (2.1) ; 1.8052 (0.6) ; 1.8007 (0.8) ; 1.5899 (0.8) ; 1.2914 (0.7) ; 0.0368 (4.3)
I.13: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.2987 (8.5) ; 2.6895 (0.8) ; 2.6652 (2.4) ; 2.6537 (7.2) ; 2.6513 (6.4) ; 2.6400 (9.6) ; 2.6326 (4.9) ; 2.6271 (16.0) ; 2.6202 (10.6) ; 2.6127 (13.9) ; 2.6040 (8.0) ; 2.6005 (7.5) ; 2.5978 (6.9) ; 2.5926 (8.0) ; 2.5870 (7.0) ; 2.5817 (5.9) ; 2.5727 (2.5) ; 2.5679 (1.2) ; 2.5484 (1.8) ; 2.5433 (1.1) ; 2.3561 (0.3) ; 2.3316 (0.7) ; 2.3176 (3.2) ; 2.3156 (3.0) ; 2.3067 (1.0) ; 2.3038 (1.1) ; 2.2924 (8.7) ; 2.2874 (6.5) ; 2.2783 (1.8) ; 2.2653 (10.7) ; 2.2609 (7.3) ; 2.2469 (2.0) ; 2.2387 (5.6) ; 2.2333 (4.4) ; 2.2258 (1.1) ; 2.2131 (1.6) ; 2.2065 (1.5) ; 2.1934 (0.4) ; 1.6331 (7.8) ; 1.4095 (0.5) ; 1.3867 (0.5) ; 1.3667 (0.5) ; 1.3422 (0.3) ; 1.3181 (0.5) ; 1.2869 (1.1) ; 0.9132 (0.4) ; 0.1036 (0.5) ; 0.0433 (0.4) ; 0.0325 (9.9) ; 0.0216 (0.4)

I.14: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.2986 (23.6) ; 3.7382 (0.3) ; 3.5094 (0.4) ; 3.3524 (0.5) ; 3.3279 (0.4) ; 2.4425 (3.0) ; 2.1341 (2.9) ; 2.1232 (3.0) ; 2.1171 (5.3) ; 2.1030 (10.2) ; 2.0908 (5.3) ; 2.0402 (1.3) ; 2.0380 (1.3) ; 1.9873 (5.2) ; 1.9752 (10.2) ; 1.9614 (5.4) ; 1.9549 (3.3) ; 1.9441 (3.0) ; 1.5840 (16.0) ; 1.3707 (0.6) ; 1.3378 (0.4) ; 1.3219 (0.9) ; 1.2922 (1.7) ; 0.9192 (0.7) ; 0.8962 (0.4) ; 0.1073 (2.2) ; 0.0482 (0.7) ; 0.0374 (23.4) ; 0.0265 (1.1)
I.15: ¹ H-NMR(499.9 MHz, d ₆ -DMSO) : δ= 3.5693 (0.7) ; 3.3138 (48.4) ; 2.6317 (0.4) ; 2.5665 (0.3) ; 2.4980 (51.2) ; 2.4387 (45.3) ; 2.3548 (0.6) ; 2.3339 (0.6) ; 2.3065 (0.4) ; 2.2891 (0.3) ; 2.2755 (0.4) ; 2.1279 (15.3) ; 2.1196 (14.8) ; 2.0799 (0.7) ; 1.9824 (0.4) ; 1.8840 (16.0) ; 1.8755 (13.6) ; 1.8375 (0.5) ; 1.7253 (0.4) ; 1.2956 (0.7) ; 1.2337 (2.6) ; 0.8540 (0.7)
I.16: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.2674 (14.3) ; 7.2563 (2.3) ; 4.1785 (0.4) ; 4.0021 (2.8) ; 1.6824 (3.4) ; 1.6698 (3.5) ; 1.6424 (1.2) ; 1.6077 (16.0) ; 1.5678 (3.6) ; 1.5212 (597.2) ; 1.3938 (1.0) ; 1.3560 (3.8) ; 1.2858 (1.8) ; 1.2553 (3.0) ; 0.9172 (0.4) ; 0.8982 (1.4) ; 0.8812 (2.6) ; 0.8639 (1.4) ; 0.0721 (0.6) ; -0.0002 (15.4)
I.17: ¹ H-NMR(600.2 MHz, d ₆ -DMSO) : δ= 3.3215 (16.0) ; 2.5340 (2.2) ; 2.5316 (1.6) ; 2.5230 (3.0) ; 2.5200 (4.0) ; 2.5168 (4.1) ; 2.5134 (10.1) ; 2.5106 (12.0) ; 2.5076 (16.0) ; 2.5044 (13.6) ; 2.4988 (8.0) ; 2.4920 (2.7) ; 2.4879 (9.3) ; 2.4738 (8.5) ; 2.4719 (9.0) ; 2.4619 (2.0) ; 2.4587 (6.6) ; 2.4545 (4.5) ; 2.4531 (4.6) ; 2.4383 (2.5) ; 2.1235 (0.6) ; 2.1190 (0.5) ; 2.1151 (1.7) ; 2.1091 (2.2) ; 2.1047 (3.1) ; 2.1001 (3.6) ; 2.0956 (5.3) ; 2.0896 (5.8) ; 2.0852 (2.9) ; 2.0819 (7.3) ; 2.0745 (3.3) ; 2.0682 (4.0) ; 2.0635 (2.4) ; 2.0542 (1.3) ; 2.0491 (0.8)
I.18: ¹ H-NMR(600.2 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.2611 (3.2) ; 1.5512 (0.3) ; 1.5389 (16.0) ; 1.4347 (0.4) ; 1.4274 (0.5) ; 1.4151 (1.3) ; 1.4126 (0.6) ; 1.4008 (0.4) ; 1.3772 (0.4) ; 1.3332 (0.5) ; 1.3103 (0.5) ; 1.2938 (1.3) ; 1.2845 (0.5) ; 1.2543 (0.8) ; 0.8431 (0.4) ; -0.0002 (3.7)
I.19: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.2599 (21.2) ; 2.6081 (1.2) ; 2.5870 (2.7) ; 2.5664 (2.5) ; 2.5436 (16.0) ; 2.5137 (0.5) ; 2.2590 (0.5) ; 2.2509 (1.0) ; 2.2428 (0.8) ; 2.2363 (0.9) ; 2.2301 (1.4) ; 2.2200 (1.1) ; 2.2108 (1.0) ; 2.2024 (0.6) ; 2.1970 (0.6) ; 2.1913 (0.4) ; 1.5423 (42.4) ; 1.2536 (0.6) ; -0.0002 (25.8)
I.20: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃) : δ= 17.5009 (2.9) ; 16.6336 (2.8) ; 15.2703 (3.2) ; 13.4484 (2.9) ; 7.5198 (5.6) ; 7.3529 (3.2) ; 7.2606 (919.4) ; 7.2231 (3.4) ; 6.9972 (5.3) ; 5.0577 (2.8) ; 4.1584 (2.7) ; 3.7038 (2.9) ; 3.6287 (3.2) ; 3.6143 (3.1) ; 3.5946 (3.5) ; 3.5083 (3.9) ; 3.4934 (3.8) ; 3.4657 (4.0) ; 1.6997 (14.7) ; 1.5479 (2101.1) ; 1.5378 (3361.1) ; 1.5025 (21.8) ; 1.4643 (5.7) ; 1.4384 (4.3) ; 1.4261 (3.8) ; 1.4073 (3.8) ; 1.3724 (16.0) ; 1.3265 (3.6) ; 1.2584 (8.3) ; 0.8828 (5.8) ; 0.8713 (3.1) ; 0.1570 (4.0) ; 0.1455 (6.2) ; -0.0002 (1239.3) ; -0.0360 (6.4) ; -0.0595 (3.6) ; -0.0774 (2.9) ; -0.1496 (7.3)

I.21: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃) : δ= 15.1982 (3.6) ; 14.7931 (3.2) ; 7.5186 (6.4) ; 7.2605 (983.8) ; 7.2308 (4.8) ; 6.9968 (5.8) ; 5.9657 (3.2) ; 5.0471 (3.3) ; 3.9375 (3.6) ; 3.7611 (4.0) ; 3.6375 (3.5) ; 3.6199 (4.1) ; 3.5812 (3.6) ; 3.5386 (5.0) ; 3.4929 (4.7) ; 3.4657 (4.4) ; 1.7339 (4.0) ; 1.6987 (12.8) ; 1.6246 (3.9) ; 1.6023 (5.6) ; 1.5463 (2074.4) ; 1.5372 (2770.8) ; 1.4983 (11.6) ; 1.4883 (9.8) ; 1.4637 (4.4) ; 1.4149 (3.3) ; 1.3717 (16.0) ; 1.3542 (3.8) ; 1.3162 (3.3) ; 1.2883 (5.5) ; 1.2568 (8.0) ; 0.8786 (3.8) ; 0.1574 (5.6) ; 0.1456 (6.2) ; 0.0311 (4.4) ; -0.0002 (1311.6) ; -0.1494 (6.2)
I.22: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.2605 (27.5) ; 5.2990 (1.2) ; 2.6557 (0.6) ; 2.6270 (7.7) ; 2.6194 (9.2) ; 2.6037 (16.0) ; 2.5831 (10.0) ; 2.5504 (2.0) ; 2.2966 (0.6) ; 2.2867 (1.6) ; 2.2794 (2.0) ; 2.2660 (5.1) ; 2.2598 (4.5) ; 2.2459 (7.2) ; 2.2401 (6.2) ; 2.2262 (4.7) ; 2.2065 (2.0) ; 2.1993 (1.6) ; 2.1889 (0.8) ; 1.5476 (45.2) ; 1.3657 (0.4) ; 1.3319 (0.4) ; 1.3191 (0.3) ; 1.2540 (1.3) ; -0.0002 (33.4)
I.23: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃) : δ= 16.0565 (2.1) ; 14.1569 (2.0) ; 7.5194 (3.5) ; 7.2919 (2.4) ; 7.2607 (651.9) ; 7.1704 (2.8) ; 7.1463 (2.1) ; 6.9973 (4.3) ; 4.1771 (2.2) ; 3.8208 (2.2) ; 3.6598 (2.2) ; 3.5711 (2.5) ; 3.5541 (2.0) ; 3.5132 (2.1) ; 3.4905 (2.2) ; 3.4777 (2.3) ; 3.4318 (2.3) ; 2.5388 (5.8) ; 1.6991 (11.6) ; 1.5761 (7.8) ; 1.5488 (1391.8) ; 1.5384 (2623.7) ; 1.3728 (16.0) ; 1.3360 (4.4) ; 1.3165 (3.8) ; 1.2965 (4.1) ; 1.2794 (6.6) ; 1.2590 (9.6) ; 1.2104 (2.4) ; 1.1242 (2.1) ; 0.8977 (3.2) ; 0.8819 (6.9) ; 0.8635 (4.0) ; 0.1575 (2.8) ; 0.1448 (4.7) ; 0.0695 (46.9) ; -0.0002 (872.7) ; -0.1153 (2.6) ; -0.1320 (2.4) ; -0.1501 (5.7)
I.24: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.2605 (8.0) ; 2.5391 (16.0) ; 1.5476 (15.8) ; 1.5163 (30.3) ; -0.0002 (10.7)
I.25: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.2603 (41.8) ; 5.2990 (0.5) ; 2.6521 (0.5) ; 2.6251 (7.4) ; 2.6176 (8.6) ; 2.6017 (16.0) ; 2.5811 (9.5) ; 2.5491 (1.8) ; 2.3147 (0.3) ; 2.2959 (0.7) ; 2.2861 (1.5) ; 2.2765 (2.1) ; 2.2651 (4.0) ; 2.2569 (3.9) ; 2.2453 (5.8) ; 2.2373 (5.2) ; 2.2256 (4.2) ; 2.2188 (3.3) ; 2.2055 (1.9) ; 2.1968 (1.4) ; 2.1895 (0.8) ; 1.5463 (69.6) ; 1.4758 (0.7) ; 1.4652 (0.6) ; 1.3558 (0.6) ; 1.3357 (0.6) ; 1.3185 (0.6) ; 1.2846 (0.6) ; 1.2549 (2.8) ; 1.2333 (0.8) ; 0.8607 (0.4) ; 0.8450 (0.4) ; 0.8327 (0.4) ; 0.0691 (1.1) ; -0.0002 (50.0) ; -0.1495 (0.3)
I.26: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃) : δ= 7.5983 (11.2) ; 7.2611 (8.5) ; 1.9425 (3.6) ; 1.9368 (3.8) ; 1.9275 (9.3) ; 1.9179 (15.9) ; 1.9089 (8.6) ; 1.8958 (3.2) ; 1.8736 (3.0) ; 1.8604 (8.3) ; 1.8516 (16.0) ; 1.8418 (9.7) ; 1.8327 (4.1) ; 1.8268 (4.0) ; 1.5528 (12.1) ; -0.0002 (11.2)

生物學數據

【0233】 下述之**實施例A**顯示藉由式(I)化合物在阿拉伯芥(*Arabidopsis thaliana*)中誘導防禦基因表現，特別是對柳酸途徑的刺激作用。因此，彼等化合物能誘導宿主防禦，從而保護植物抵禦包括細菌與真菌等多種病原體。

【0234】 下述之**實施例B與C**顯示式(I)化合物對包括細菌與真菌等各種病

原體的體外細胞測試直接失活，從而說明式(I)化合物作為植物宿主防禦誘導劑的作用方式。

【0235】 下述之**實施例D、E、F、及G**係藉由刺激植物抵禦包括細菌與真菌等感染植物的各種病原體，顯示式(I)化合物在植物中的化合物體內活性。

【0236】 下述之**實施例H、I、及J**顯示WO2004/062361教導所製備之比較用化合物(CMP1)與本發明化合物在植物中的體內活性。比較用化合物CMP1與本發明化合物在結構上的不同之處在於， R^3 為氫，且同時 R^1 與 R^2 為鹵素(溴)。比較CMP1與本發明化合物的活性顯示，此先前技術化合物顯然活性較低，因此無法提供本發明化合物有利的技術效果。

實施例A：在阿拉伯芥(*Arabidopsis thaliana*)中誘導防禦基因表現

【0237】 將阿拉伯芥(*Arabidopsis thaliana*)報導子植物培養五天，該植物含有綠色螢光蛋白質(GFP)編碼序列連接至PR1 (致病相關蛋白質I)基因(AT2G14610)之柳酸酯反應啟動子序列，隨後以化合物噴霧。在噴霧後第3天，以購自Leica Microsystems (Wetzlar, Germany)之MacroFluo儀器評估植物螢光。螢光係以Meta-Morph Microscopy Automation & Image Analysis Software (Molecular Devices, Sunnyvale, Calif., United States)進行定量。

【0238】 將假性(mock)處理之葉的背景螢光值設定為1.00。柳酸處理(300 ppm)產生相對之螢光值2.70，證明了測試系統的有效性。

【0239】 在此測試中，下列之本發明化合物在300 ppm的化合物濃度下顯示出至少大於2的相對螢光值：I.01；I.02；I.03；I.04；I.06；I.07；I.08；I.09；I.12；I.15；I.16；I.17。

【0240】 在此測試中，下列之本發明化合物在75 ppm的化合物濃度下顯示出至少大於2的相對螢光值：I.02；I.06；I.07；I.08；I.09；I.11；I.16；I.17。

【0241】 柳酸酯為抵禦植物病原體的主要防禦激素。上述之所有化合物皆能刺激柳酸途徑，因此可保護植物抵禦各種病原體。

實施例B：菜豆炭疽病菌(*Colletotrichum lindemuthianum*)體外細胞測試

溶劑： DMSO

培養基： 14.6g無水D-葡萄糖(VWR)，7.1g黴菌蛋白朊(Mycological Peptone)(Oxoid)，1.4g顆粒型Yeast Extract (Merck)，QSP 1公升

接種物： 孢子懸浮液

【0242】 將殺真菌劑溶於DMSO中，並以該溶液製備所需之濃度範圍。試驗中使用之DMSO最終濃度 $\leq 1\%$ 。

【0243】 製備菜豆炭疽病菌的孢子懸浮液，並稀釋成所需之孢子密度。

【0244】 在液體培養試驗中評估殺真菌劑抑制孢子萌發與菌絲生長的能力。化合物以所需之濃度添加至具有孢子的培養基中。在培養6天後，利用菌絲體生長的光譜測量法確定化合物的真菌毒性。比較含有殺真菌劑之培養孔的吸光度與不含殺真菌劑之對照組培養孔的吸光度，確定真菌生長的抑制作用。

【0245】 在此測試中，下列之本發明化合物在20 ppm的活性成分濃度下顯示無直接活性(功效低於或等於30%)：I.02；I.03；I.04；I.05；I.06；I.07；I.08；I.09；I.11；I.12；I.13；I.14；I.15；I.16；I.17；I.19；I.20；I.21；I.22；I.23；I.24；I.25。

實施例C：十字花科黑腐病菌體外細胞測試

溶劑： DMSO

培養基： LB肉湯培養基(Luria Broth Miller) Sigma

接種物： 細菌懸浮液

【0246】 將化合物溶於DMSO中，並以該溶液製備所需之濃度範圍。試驗中使用之DMSO最終濃度 $\leq 1\%$ 。

【0247】 由在液體培養基中生長的細菌預培養物製備接種物，並稀釋至所需的光學密度(OD)。

【0248】 在液體培養試驗中評估化合物抑制細菌生長的能力。化合物以所

需之濃度添加至具有細菌懸浮液的培養基中。在培養24小時後，利用細菌生長的光譜測量法確定化合物的功效。比較含有化合物之培養孔的吸光度與不含活性成分之對照組培養孔的吸光度，確定抑制作用。

【0249】 在此測試中，下列之本發明化合物在20 ppm的活性成分濃度下顯示無直接活性(功效低於或等於30%)：I.01；I.02；I.03；I.04；I.05；I.06；I.07；I.08；I.09；I.11；I.12；I.13；I.14；I.15；I.16；I.17；I.19；I.20；I.21；I.22；I.23；I.24；I.25。

實施例D：菜豆炭疽病菌(*Colletotrichum lindemuthianum*) (豆炭疽病)之體內預防性測試

【0250】 藉由在丙酮/二甲基亞碸/tween[®]混合物中均質化，製備受測活性成分，隨後以水稀釋，以取得所需之活性原料濃度。

【0251】 藉由噴霧如上述製備之活性成分，處理豆類幼苗。對照組植物僅處理丙酮/二甲基亞碸/tween[®]水溶液。

【0252】 在72小時後，利用菜豆炭疽病菌(*Colletotrichum lindemuthianum*)孢子水懸浮液噴霧葉片以污染植物。污染之豆類植物在20°C與100%相對濕度下培養24小時，隨後在20°C與90%相對濕度下培養5天。

【0253】 在接種後6天評估測試。0%意指相當於對照組植物的功效，而100%的功效意指未觀察到病害。

【0254】 在此測試中，下列之本發明化合物在500 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於70%與79%之間：I.26。

【0255】 在此測試中，下列之本發明化合物在500 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於80%與89%之間：I.07；I.12。

【0256】 在此測試中，下列之本發明化合物在500 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於90%與100%之間：I.06；I.08；I.09；I.11；I.13。

【0257】 在此測試中，下列之本發明化合物在31 ppm的活性成分濃度下顯

示功效介於70%與79%之間：I.09；I.25。

【0258】 在此測試中，下列之本發明化合物在31 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於80%與89%之間：I.22。

實施例E：油菜露菌病菌(*Peronospora parasitica*)(十字花科霜黴)之體內預防性測試

【0259】 藉由在丙酮/二甲基亞碲/tween[®]混合物中均質化，製備受測活性成分，隨後以水稀釋，以取得所需之活性原料濃度。

【0260】 藉由噴霧如上述製備之活性成分，處理甘藍幼苗。對照組植物僅處理丙酮/二甲基亞碲/tween[®]水溶液。

【0261】 在72小時後，利用油菜露菌病菌(*Peronospora parasitica*)孢子水懸浮液噴霧葉片以污染植物。污染之甘藍植物在20°C與100%相對濕度下培養5天。

【0262】 在接種後5天評估測試。0%意指相當於對照組植物的功效，而100%的功效意指未觀察到病害。

【0263】 在此測試中，下列之本發明化合物在125 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於80%與89%之間：I.01；I.20；I.24。

【0264】 在此測試中，下列之本發明化合物在125 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於90%與100%之間：I.05；I.06；I.07；I.08；I.09；I.11；I.12；I.13；I.16；I.17；I.19；I.21；I.22；I.26。

實施例F：十字花科黑腐病菌(甘藍黑腐菌)之體內預防性測試

【0265】 藉由在丙酮/二甲基亞碲/tween[®]混合物中均質化，製備受測活性成分，隨後以水稀釋，以取得所需之活性原料濃度。

【0266】 藉由噴霧如上述製備之活性成分，處理甘藍幼苗。對照組植物僅處理丙酮/二甲基亞碲/tween[®]水溶液。

【0267】 在72小時後，利用十字花科黑腐病菌之細菌水懸浮液噴霧葉片以污染植物。污染之甘藍植物在27°C與95%相對濕度下培養8或10天。

【0268】 在接種後8或10天評估測試。0%意指相當於對照組植物的功效，而100%的功效意指未觀察到病害。

【0269】 在此測試中，下列之本發明化合物在31 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於70%與79%之間：I.03；I.09；I.11；I.12；I.26。

【0270】 在此測試中，下列之本發明化合物在31 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於80%與89%之間：I.01；I.08。

【0271】 在此測試中，下列之本發明化合物在31 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於90%與100%之間：I.06；I.13。

【0272】 在此測試中，下列之本發明化合物在125 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於70%與79%之間：I.03；I.08；I.15。

【0273】 在此測試中，下列之本發明化合物在125 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於80%與89%之間：I.02；I.13。

【0274】 在此測試中，下列之本發明化合物在125 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於90%與100%之間：I.06；I.11；I.12。

實施例G：菜豆黑銹病菌(*Uromyces appendiculatus*)(豆銹)之體內預防性測試

【0275】 藉由在丙酮/二甲基亞碸/tween[®]混合物中均質化，製備受測活性成分，隨後以水稀釋，以取得所需之活性原料濃度。

【0276】 藉由噴霧如上述製備之活性成分，處理豆類幼苗。對照組植物僅處理丙酮/二甲基亞碸/tween[®]水溶液。

【0277】 在72小時後，利用菜豆黑銹病菌(*Uromyces appendiculatus*)孢子水懸浮液噴霧葉片以污染植物。污染之豆類植物在20°C與100%相對濕度下培養24小時，隨後在20°C與70-80%相對濕度下培養9天。

【0278】 在接種後10天評估測試。0%意指相當於對照組植物的功效，而100%的功效意指未觀察到病害。

【0279】 在此測試中，下列之本發明化合物在500 ppm的活性成分濃度下

顯示功效介於70%與79%之間：I.02。

【0280】 在此測試中，下列之本發明化合物在500 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於80%與89%之間：I.15。

【0281】 在此測試中，下列之本發明化合物在500 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於90%與100%之間：I.01；I.04；I.05；I.06；I.07；I.08；I.09；I.11；I.12；I.13；I.26。

【0282】 在此測試中，下列之本發明化合物在31 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於70%與79%之間：I.06；I.23。

【0283】 在此測試中，下列之本發明化合物在31 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於80%與89%之間：I.11；I.20。

【0284】 在此測試中，下列之本發明化合物在31 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於90%與100%之間：I.08；I.09；I.16；I.19；I.21；I.22；I.25。

【0285】 在此測試中，下列之本發明化合物在125 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於70%與79%之間：I.06；I.20。

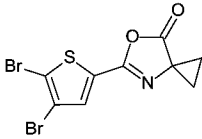
【0286】 在此測試中，下列之本發明化合物在125 ppm的活性成分濃度下顯示功效介於90%與100%之間：I.08；I.09；I.11；I.12；I.13；I.16；I.17；I.19；I.21；I.22；I.24；I.25。

實施例H：比較例

【0287】 在如實施例F所述之同一條件下，在十字花科黑腐病菌(甘藍黑腐菌)之體內預防性測試中，測試化合物 CMP1。

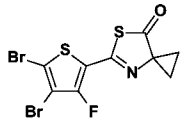
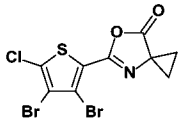
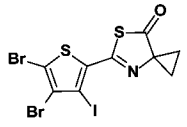
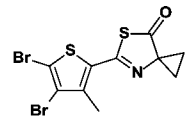
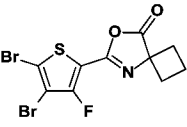
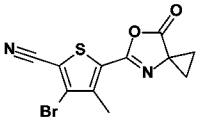
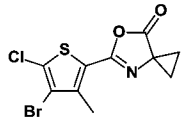
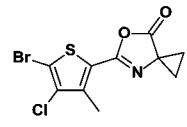
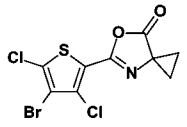
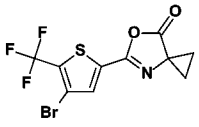
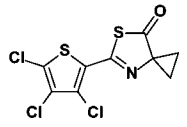
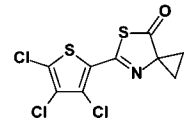
【0288】 依據WO2004/062361之教示，製備化合物CMP1。

【0289】 結果如下表所示。

實施例	結構	在 125 ppm 時的 功效(%)	在 31 ppm 時的 功效(%)
CMP1		37*	35*

* 4次測試的算術平均值

【0290】 下表之本發明式(I)化合物顯示呈現出比結構上相關之化合物CMP1更好的功效。

實 施 例	結構	實 施 例	結構	實 施 例	結構	實 施 例	結構
I.03		I.08		I.15		I.02	
I.13		I.06		I.11		I.12	
I.09		I.26		I.01		I.01	

【0291】 本發明式(I)化合物在125 ppm的濃度下測試時，顯示呈現出比結構上相關之化合物CMP1更好的功效。

【0292】 更具體地，在125 ppm的濃度時，化合物I.03；I.08；I.15顯示呈現出功效介於70%與79%之間，化合物I.02；I.13顯示呈現出功效介於80%與89%之間，且化合物I.06；I.11；I.12顯示呈現出功效介於90%與100%之間，而CMP1在同一濃度時顯示呈現出功效低於40%。

【0293】 本發明式(I)化合物在31 ppm的濃度下測試時，顯示呈現出比結構

上相關之化合物CMP1更好的功效。

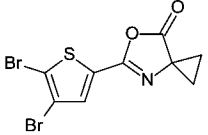
【0294】更具體地，在31 ppm的濃度時，化合物I.03；I.09；I.11；I.12；I.26顯示呈現出功效介於70%與79%之間，化合物I.01；I.08顯示呈現出功效介於80%與89%之間，且化合物I.06；I.13顯示呈現出功效介於90%與100%之間，而CMP1在同一濃度時顯示呈現出功效低於40%。

實施例I：比較例

【0295】在如實施例G所述之同一條件下，在菜豆黑銹病菌(*Uromyces appendiculatus*)(豆銹)之體內預防性測試中，測試化合物 CMP1。

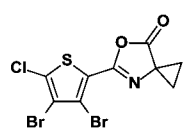
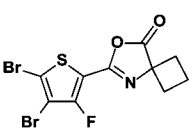
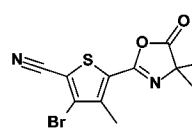
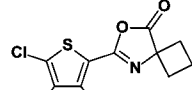
【0296】依據WO2004/062361之教示，製備化合物CMP1。

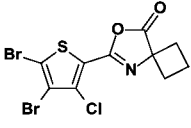
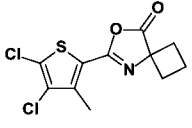
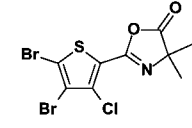
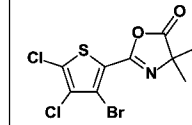
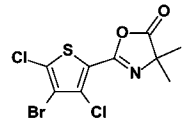
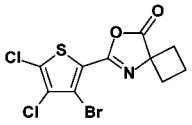
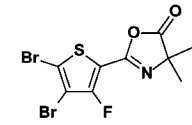
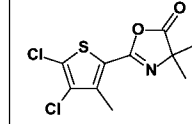
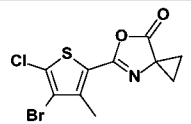
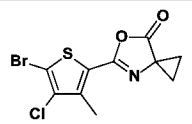
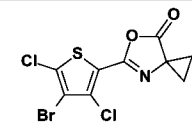
【0297】結果如下表所示。

實施例	結構	在 125 ppm 時的 功效(%)	在 31 ppm 時的 功效(%)
CMP1		42*	32*

*3次測試的算術平均值

【0298】下表之本發明式(I)化合物顯示呈現出比結構上相關之化合物CMP1更好的功效。

實施例	結構	實施例	結構	實施例	結構	實施例	結構
I.08		I.13		I.06		I.25	

實施例	結構	實施例	結構	實施例	結構	實施例	結構
I.17		I.19		I.20		I.23	
I.21		I.22		I.16		I.24	
I.11		I.12		I.09			

【0299】 本發明式(I)化合物在125 ppm的濃度下測試時，顯示呈現出比結構上相關之化合物CMP1更好的功效。

【0300】 更具體地，在125 ppm的濃度時，化合物I.06；I.20顯示呈現出功效介於70%與79%之間，且化合物I.08；I.09；I.11；I.12；I.13；I.16；I.17；I.19；I.21；I.22；I.24；I.25顯示呈現出功效介於90%與100%之間，而CMP1在同一濃度時顯示呈現出功效為42%。

【0301】 本發明式(I)化合物在31 ppm的濃度下測試時，顯示呈現出比結構上相關之化合物CMP1更好的功效。

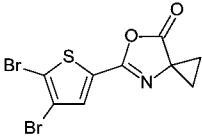
【0302】 更具體地，在31 ppm的濃度時，化合物I.06；I.23顯示呈現出功效介於70%與79%之間，化合物I.11；I.20顯示呈現出功效介於80%與89%之間，且化合物I.08；I.09；I.16；I.19；I.21；I.22；I.25顯示呈現出功效介於90%與100%之間，而CMP1在同一濃度時顯示呈現出功效低於40%。

實施例J：比較例

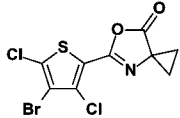
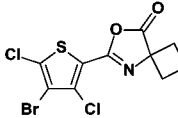
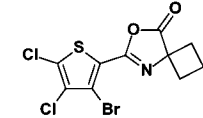
【0303】 在如實施例D所述之同一條件下，在菜豆炭疽病菌(*Colletotrichum lindemuthianum*)(豆炭疽病)之體內預防性測試中，測試化合物 CMP1。

【0304】 依據WO2004/062361之教示，製備化合物CMP1。

【0305】 結果如下表所示。

實施例	結構	在 31 ppm 時的功效 (%)
CMP1		19

【0306】 下表之本發明式(I)化合物顯示呈現出比結構上相關之化合物CMP1更好的功效。

實 施 例	結構	實 施 例	結構	實 施 例	結構
I.09		I.25		I.22	

【0307】 本發明式(I)化合物在31 ppm的濃度下測試時，顯示呈現出比結構上相關之化合物CMP1更好的功效。

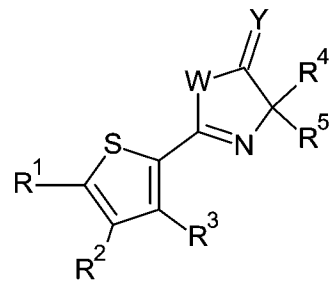
【0308】 更具體地，在31 ppm的濃度時，化合物I.09；I.25顯示呈現出功效介於70%與79%之間，且化合物I.22顯示呈現出功效介於90%與100%之間，而CMP1在同一濃度時顯示呈現出功效低於20%。

【符號說明】 無

【生物材料寄存】 無

【發明申請專利範圍】

【請求項1】 一種式(I)化合物：



(I)

其中

R¹、R²係彼此獨立地選自於由鹵素、氰基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵烷基組成之群組；

R³係選自於由氫、鹵素、氰基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵烷基組成之群組；

W、Y係彼此獨立地選自於由氧、硫組成之群組；

R⁴與R⁵係彼此獨立地選自於由氫、C₁-C₆-烷基、芳基-C₁-C₆-烷基或C₃-C₆-碳環組成之群組，其中非環R⁴、R⁵基可經一或多個R^a取代基取代且其中環R⁴、R⁵基可經一或多個R^b取代基取代；或者R⁴與R⁵與其連接之碳原子一起形成C₃-C₆-碳環或3至6員雜環，其中該C₃-C₆-碳環與3至6員雜環可經一或多個R^b取代基取代，R^a係獨立地選自於由硝基、羥基、氰基、羧基、胺基、氫硫基、五氟-λ⁶-氫硫基、甲醯基、胺甲醯基、胺甲酸酯、C₃-C₇-環烷基、具有1至5個鹵素原子之C₃-C₇-鹵環烷基、C₁-C₈-烷基胺基、二-C₁-C₈-烷基胺基、C₁-C₈-烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷氧基、C₁-C₈-烷基氫硫基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基氫硫基、C₁-C₈-烷基羰基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基、C₁-C₈-烷基胺甲醯基、二-C₁-C₈-烷基胺甲醯基、C₁-C₈-烷氧基羰基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷氧基羰基、C₁-C₈-烷基羰基氧基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基氧基、C₁-C₈-烷基羰基胺基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基胺基、C₁-C₈-烷基亞磺醯基、具

有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基亞磺醯基、C₁-C₈-烷基磺醯基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基磺醯基；C₁-C₈-烷基磺醯基胺基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基磺醯基胺基；胺磺醯基；C₁-C₈-烷基胺磺醯基與二-C₁-C₈-烷基胺磺醯基組成之群組，R^b係獨立地選自於由鹵素原子、硝基、羥基、氰基、羧基、胺基、氫硫基、五氟-λ⁶-氫硫基、甲醯基、胺甲醯基、胺甲酸酯、C₁-C₈-烷基、C₃-C₇-環烷基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基、具有1至5個鹵素原子之C₃-C₇-鹵環烷基、C₂-C₈-烯基、C₂-C₈-炔基、C₁-C₈-烷基胺基、二-C₁-C₈-烷基胺基、C₁-C₈-烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷氧基、C₁-C₈-烷基氫硫基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基氫硫基、C₁-C₈-烷基羰基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基、C₁-C₈-烷基胺甲醯基、二-C₁-C₈-烷基胺甲醯基、C₁-C₈-烷氧基羰基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷氧基羰基、C₁-C₈-烷基羰基氧基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基氧基、C₁-C₈-烷基羰基胺基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基羰基胺基、C₁-C₈-烷基氫硫基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基氫硫基、C₁-C₈-烷基亞磺醯基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基亞磺醯基、C₁-C₈-烷基磺醯基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基磺醯基、C₁-C₈-烷基磺醯基胺基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈-鹵烷基磺醯基胺基、胺磺醯基、C₁-C₈-烷基胺磺醯基、及二-C₁-C₈-烷基胺磺醯基組成之群組；

前提是，若R¹為鹵素且R²為鹵素，則R³係選自於由鹵素、氰基、C₁-C₆-烷基或C₁-C₆-鹵烷基組成之群組；且

前提是，若R¹與R²相同且為溴或氯，則R³為氰基或C₁-C₆-鹵烷基或W為硫或R⁴與R⁵不與其連接之碳原子一起形成環丙基。

【請求項2】 如請求項1之化合物，其中R¹係選自於由鹵素、氰基組成之群組。

【請求項3】 如請求項1或2之化合物，其中R²為鹵素。

【請求項4】 如請求項1或2之化合物，其中R³係選自於由鹵素、C₁-C₆-烷基組

成之群組。

【請求項5】 如請求項1或2之化合物，其中 R^4 與 R^5 與其連接之碳原子一起形成 C_3 - C_6 -碳環。

【請求項6】 如請求項1或2之化合物，其中W為氧。

【請求項7】 如請求項1或2之化合物，其中Y為氧。

【請求項8】 一種組成物，其包含至少一種如請求項1至7中任一項之式(I)化合物與至少一種農業上適用之助劑。

【請求項9】 一種用於防治植物之細菌及/或細菌性病害之方法，其包含將至少一種如請求項1至7中任一項之式(I)化合物或如請求項8之組成物施加至植物、植物部位、種子、果實、或植物生長之土壤的步驟。

【請求項10】 一種如請求項1至7中任一項之式(I)化合物或如請求項8之組成物在植物或植物部位上防治細菌性及/或真菌性病害之用途。