發明專利說明書

200536478

（本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫）

※ 申請案號：94103287

※ 申請日期：94.2.3　　※IPC 分類：A01N 37/18

一、發明名稱：（中文/英文）

2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類

2-HALOFURYL/THIENYL-3-CARBOXAMIDES

二、申請人：（共 1 人）

姓名或名稱：（中文/英文）

拜耳作物科學股份有限公司

BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT

代表人：（中文/英文）

1.包亞歷博士/DR. BADER, AXEL

2.羅勃特博士/DR. KRIEG, ROBERT

住居所或營業所地址：（中文/英文）

德國莫罕城艾諾貝耳街 50 號

Alfred-Nobel-Strasse 50, 40789 Monheim, Germany

國　籍：（中文/英文）

德國/Germany

三、發明人：（共 7 人）

姓　名：（中文/英文）

1.杜洛夫/DUNKEL, RALF

2.易漢斯/ELBE, HANS-LUDWIG

3.葛朱格/GREUL, JOERG NICO

4.哈賓特/HARTMANN, BENOIT

5.達彼得/DAHMEN, PETER

6.庫卡爾/KUCK, KARL-HEINZ

7.瓦優克/WACHENDORFF-NEUMANN, ULRIKE

國　籍：(中文/英文)

1.~3.和 5.~7.均為德國/Germany

4.法國/France

四、聲明事項：

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

☑ 申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號　順序註記】

☑ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

德國;西元 2004 年 02 月 06 日; 102004005785.0

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號　順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼　順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼　順序註記】

☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

6.庫卡爾/KUCK, KARL-HEINZ

7.瓦優克/WACHENDORFF-NEUMANN, ULRIKE

國　籍：（中文/英文）

1.~3.和 5.~7.均為德國/Germany

4.法國/France

四、聲明事項：

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

☑ 申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號　順序註記】

☑ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

德國;西元 2004 年 02 月 06 日; 102004005785.0

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號　順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼　順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼　順序註記】

☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

九、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明乃有關新穎之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類、其等之許多製備方法及其作為防治有害微生物之用途。

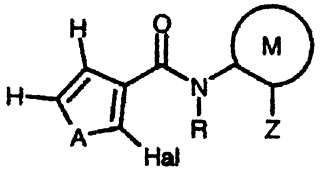
【先前技術】

一般已知很多羧醯胺類具有殺真菌性質(參考，例如，EP-A 0 737 682、EP-A 0 591 699、EP-A 0 589 301、EP-A 0 545 099、DE-A 24 09 011、DE-A 20 06 472、JP-A 2001-302605、JP-A 10-251240、JP-A 8-176112、JP-A 8-92223 與 JP-A 53-72823)。因此，其呋喃基/噻吩基環於位置 2 被甲基或三氟甲基取代的很多呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類已為人所知。雜環位置 2 被鹵素取代的唯一羧醯胺類為 2,5-二氯-N-{3'-[(甲氧亞胺基)甲基]聯二苯-2-基}噻吩-3-羧醯胺及 2,5-二氯-N-{4'-[(甲氧亞胺基)甲基]聯二苯-2-基}噻吩-3-羧醯胺(參考 WO 02/08197)。其等化合物活性佳；然而，於若干情形下，例如於低施加率時，並不令人滿意。

2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類，其呋喃基/噻吩基環除了鹵素取代基外未攜帶另外的取代基，乃新穎之化合物。

【發明內容】

本發明頃提供具下式(I)之新穎之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



(I)

式中

A　代表 O (氧)或 S (硫)，

Hal　代表鹵素，

R　代表氫、C_1-C_8-烷基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_3-C_8-環烷基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_6-鹵烷基、C_1-C_4-鹵烷基硫基、C_1-C_4-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_3-C_8-鹵基環烷基；甲醯基、甲醯基-C_1-C_3-烷基、(C_1-C_3-烷基)羰基-C_1-C_3-烷基、(C_1-C_3-烷氧基)羰基-C_1-C_3-烷基；各具有 1 至 13 個氟、氯及/或溴原子之鹵基-(C_1-C_3-烷基)羰基-C_1-C_3-烷基、鹵基-(C_1-C_3-烷氧基)羰基-C_1-C_3-烷基；

(C_1-C_8-烷基)羰基、(C_1-C_8-烷氧基)羰基、(C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基)羰基、(C_3-C_8-環烷基)羰基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之(C_1-C_6-鹵烷基)羰基、(C_1-C_6-鹵基烷氧基)羰基、(鹵基-C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基)羰基、(C_3-C_8-鹵基環烷基)羰基；或 $-C(=O)C(=O)R^1$、$-CONR^2R^3$ 或 $-CH_2NR^4R^5$，

R^1　代表氫、C_1-C_8-烷基、C_1-C_8-烷氧基、C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_3-C_8-環烷基；各具有 1 至 9 個氟、氯

及/或溴原子之 C_1-C_6-鹵烷基、C_1-C_6-鹵基烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_3-C_8-鹵基環烷基，

R^2 與 R^3 彼此獨立地各代表氫、C_1-C_8-烷基、C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_3-C_8-環烷基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_8-鹵烷基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_3-C_8-鹵基環烷基，

R^2 與 R^3 進一步和與其連接之氮原子一起形成具有 5 至 8 個環原子之飽和雜環，其視需要被得自包括鹵素與 C_1-C_4-烷基之組群之相同或不同取代基單或多取代，其中雜環可含有一個或兩個另外之得自包括氧、硫與 NR^6 之組群之不相鄰雜原子，

R^4 與 R^5 彼此獨立地代表氫、C_1-C_8-烷基、C_3-C_8-環烷基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_8-鹵烷基、C_3-C_8-鹵基環烷基，

R^4 與 R^5 進一步和與其連接之氮原子一起形成具有 5 至 8 個環原子之飽和雜環，其視需要被得自包括鹵素與 C_1-C_4-烷基之組群之相同或不同取代基單或多取代，其中雜環可含有 1 或 2 個另外之得自包括氧、硫與 NR^6 之組群之不相鄰雜原子，

R^6 代表氫或 C_1-C_6-烷基，

M 代表苯基、噻吩、吡啶、嘧啶、嗒吡或吡吡環，各者被 R^7 單取代，或代表被 R^{7-A} 取代之噻唑環，

R^7 代表氫、氟、氯、甲基、異丙基、甲硫基或三氟甲基，

R^{7-A} 代表氫、甲基、甲硫基或三氟甲基，

Z 代表 Z^1、Z^2、Z^3 或 Z^4，其中

Z^1 代表苯基，其視需要被相同或不同取代基單-至五取代，

Z^2 代表雙環烷基或環烷基，其視需要被相同或不同取代基單或多五取代，

Z^3 代表未經取代之 C_2-C_{20}-烷基或代表 C_1-C_{20}-烷基，其視需要被選自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：鹵素、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、鹵烷基硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基、鹵基二烷胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$ 與 C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被選自包括鹵素與 C_1-C_4-烷基之組群之相同或不同取代基單或多取代，

Z^4 代表 C_2-C_{20}-烯基或 C_2-C_{20}-炔基，各者視需要被選自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：鹵素、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、鹵烷基硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基、鹵基二烷胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$ 與 C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被選自包括鹵素與 C_1-C_4-烷基之組群之相同或不同取代基單或多取代，

R^8 與 R^9 彼此獨立地代表氫、C_1-C_8-烷基、C_1-C_8-烷氧基、

C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷硫基-C_1-C_4-烷基或 C_1-C_6-鹵烷基，

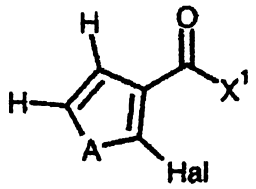
R^{10} 代表氫、C_1-C_8-烷基、C_1-C_8-烷氧基、C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷硫基-C_1-C_4-烷基、C_2-C_8-烯基、C_2-C_8-炔基、C_1-C_6-鹵烷基、C_2-C_6-鹵烯基、C_2-C_6-鹵炔基、C_3-C_6-環烷基，或代表各者視需要經取代之苯基或苯基烷基，

或

M 與 Z 一起代表 1H-2,3-二氫茚-4-基、1,3-二氫-2-苯並呋喃-4-基或 1,3-二氫-2-苯並噻吩-4-基，各者視需要被甲基單至三取代。

再者，頃發現 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類係於下述條件下製得

a) 使式(II)之羧酸衍生物



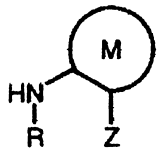
(II)

式中

A 與 Hal 如上文之界定及

X^1 代表鹵素或羥基

適當時於觸媒存在下、適當時於縮合劑存在下、適當時於酸結合劑存在下及適當時於稀釋劑存在下，與式(III)之苯胺衍生物反應

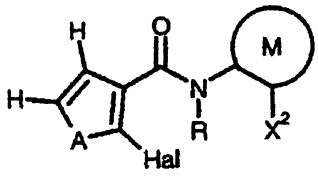


(III)

，

或

b) 使式(IV)之鹵基羧醯胺類



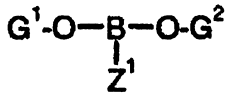
(IV)

式中

A、Hal、R與M如上文之界定，

X^2 代表溴、碘或三氟甲基磺酸根，

於觸媒存在下、適當時於酸結合劑存在下及適當時於稀釋劑存在下，與式(V)之硼酸衍生物反應



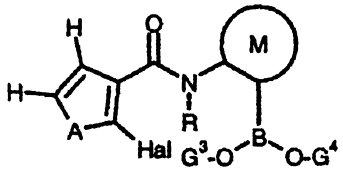
(V)

式中

Z^1 如上文之界定及

G^1與G^2各代表氫或一起代表四甲基伸乙基，或

c) 使式(VI)之硼酸衍生物



(VI)

式中

A、Hal、R與M如上文之界定，

G^3與G^4各代表氫或一起代表四甲基伸乙基，

適當時於觸媒存在下、適當時於酸結合劑存在下及適當時於稀釋劑存在下，與式(VII)之苯基衍生物反應

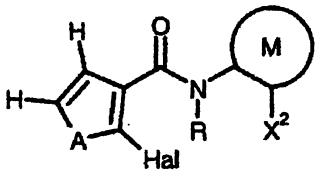
$$X^3—Z^1 \qquad (VII)$$

式中

Z^1　如上文之界定及

X^3　代表溴、碘或三氟甲基磺酸根，或

d) 使式(IV)之鹵基羧醯胺類



(IV)

式中

A、Hal、R與M如上文之界定，

X^2　代表溴、碘或三氟甲基磺酸根，

於鈀或鎳觸媒存在下及於 4,4,4',4',5,5,5',5'-八甲基-2,2'-雙-1,3,2-二噁硼茂烷存在下、適當時於酸結合劑存在下及適當時於稀釋劑存在下，與式(VII)之苯基衍生物反應

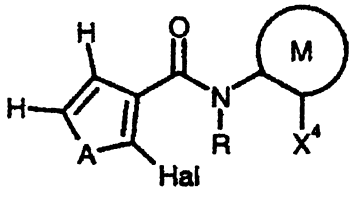
$$X^3—Z^1 \qquad (VII)$$

式中

Z^1　如上文之界定及

X^3　代表溴、碘或三氟甲基磺酸根，或

e) 使式(I-a)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類適當時於稀釋劑存在下及適當時於觸媒存在下進行氫化反應



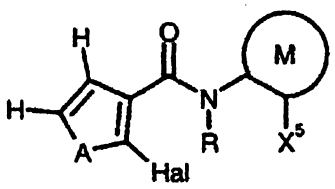
(I-a)

式中

A、Hal、R與M如上文之界定，

X^4 代表 C_2-C_{20}-烯基或 C_2-C_{20}-炔基，各者視需要被選自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：鹵素、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、鹵烷基硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基、鹵基二烷胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$ 及/或 C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或 C_1-C_4-烷基取代，或

f) 使式(VIII)之羥烷基羧醯胺類適當時於稀釋劑存在下及適當時於酸存在下進行脫水反應



(VIII)

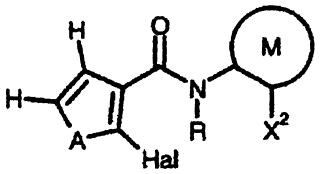
式中

A、Hal、R與M如上文之界定，

X^5 代表 C_2-C_{20}-羥烷基，其視需要附加地被選自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：鹵素、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、鹵烷基硫基、鹵烷

基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基、鹵基二烷胺基、-$SiR^8R^9R^{10}$與C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或C_1-C_4-烷基取代，或

g) 使式(IV)之鹵基羧醯胺類



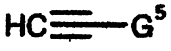
(IV)

式中

A、Hal、R與M如上文之界定，

X^2 代表溴、碘或三氟甲基磺酸根，

與式(IX)之炔



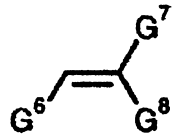
(IX)

式中

G^5 代表C_2-C_{18}-烷基，其視需要被選自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：鹵素、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、鹵烷基硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基、鹵基二烷胺基、-$SiR^8R^9R^{10}$與C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或C_1-C_4-烷基取代，

或與式(X)之烯烴適當時於稀釋劑存在下、適當時於酸

結合劑存在下及適當時於一或多種觸媒存在下進行反應

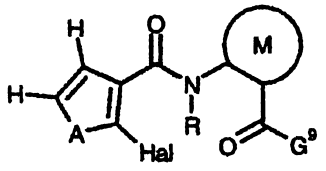


(X)

式中

G^6、G^7與G^8彼此獨立地各自代表氫或烷基，其視需要被選自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：鹵素、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、鹵烷基硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基、鹵基二烷胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$與C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或 C_1-C_4-烷基取代及開鏈分子部分(不含取代基)之碳原子總數不超過20個，或

h) 使式(XI)之酮類



(XI)

式中

A、Hal、R與M如上文之界定，

G^9 代表氫或 C_1-C_{18}-烷基，其視需要被選自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：鹵素、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、

烷胺基、二烷胺基、鹵烷基硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基、鹵基二烷胺基、-$SiR^8R^9R^{10}$與 C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或 C_1-C_4-烷基取代，

適當時於稀釋劑存在下，與式(XII)之磷化合物反應

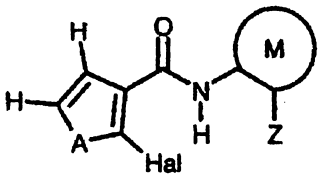
G^{10}—Px (XII)

式中

G^{10} 代表 C_1-C_{18}-烷基，其視需要被選自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：鹵素、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、鹵烷基硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基、鹵基二烷胺基、-$SiR^8R^9R^{10}$ 及/或 C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或 C_1-C_4-烷基取代，

Px 代表-$P^+(C_6H_5)_3Cl^-$、-$P^+(C_6H_5)_3Br^-$、-$P^+(C_6H_5)_3I^-$、-$P(=O)(OCH_3)_3$ 或-$P(=O)(OC_2H_5)_3$ 等基團，或

i) 使式(I-b)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



(I-b)

式中

A、Hal、R、M 與 Z 如上文之界定，

於鹼存在下及於稀釋劑存在下，與式(XIII)之鹵化物反應

$$R^a—X^6 \qquad (XIII)$$

式中

R^a 代表 C_1-C_8-烷基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_3-C_8-環烷基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_6-鹵烷基、C_1-C_4-鹵烷基硫基、C_1-C_4-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_3-C_8-鹵基環烷基；甲醯基、甲醯基-C_1-C_3-烷基、(C_1-C_3-烷基)羰基-C_1-C_3-烷基、(C_1-C_3-烷氧基)羰基-C_1-C_3-烷基；各具有 1 至 13 個氟、氯及/或溴原子之鹵基-(C_1-C_3-烷基)羰基-C_1-C_3-烷基、鹵基-(C_1-C_3-烷氧基)羰基-C_1-C_3-烷基；

(C_1-C_8-烷基)羰基、(C_1-C_8-烷氧基)羰基、(C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基)羰基、(C_3-C_8-環烷基)羰基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之(C_1-C_6-鹵烷基)羰基、(C_1-C_6-鹵基烷氧基)羰基、(鹵基-C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基)羰基、(C_3-C_8-鹵基環烷基)羰基；或 -C(=O)C(=O)R^1、-CONR^{2}R^3 或 -CH$_2$NR^{4}R^5，

R^1、R^2、R^3、R^4 與 R^5 如上文之界定，

X^6 代表氯、溴或碘。

最後並發現式(I)之新穎之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類具有很好的殺微生物性質，可於作物保護及原料保護上作為防治有害微生物之用。

出乎意料地，式(I)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類比具有相同作用指針之先前技藝中結構最為類似之活性化合物具有頗為更佳之殺真菌活性。

適當時，根據本發明之化合物可呈不同的可能異構物形式(特別是立體異構物，例如，E與Z、疊同與對映型及光學異構物、以及適當時之互變異構物)之混合物存在。該等E與Z、疊同與對映型及光學異構物、彼等異構物之任何混合物以及可能之互變異構物形式均在本發明所請求之專利範圍內。

式(I)提供根據本發明 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類之概括性界定。茲於下文敘述上文及下文所示諸式之較佳基團界定。彼等界定亦應用於式(I)之終產物及，相同地，應用於所有中間產物。

A　較佳為代表 O (氧)。

A　進一步較佳為代表 S (硫)。

Hal　較佳為代表氟、氯、溴或碘。

Hal　特佳為代表氯、溴或碘。

Hal　更特佳為代表碘。

R　較佳為代表氫、C_1-C_6-烷基、C_1-C_4-烷基亞磺醯基、C_1-C_4-烷基磺醯基、C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基、C_3-C_6-

環烷基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_4-鹵烷基、C_1-C_4-鹵烷基硫基、C_1-C_4-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基、C_3-C_8-鹵基環烷基；甲醯基、甲醯基-C_1-C_3-烷基、(C_1-C_3-烷基)羰基-C_1-C_3-烷基、(C_1-C_3-烷氧基)羰基-C_1-C_3-烷基；各具有 1 至 13 個氟、氯及/或溴原子之鹵基-(C_1-C_3-烷基)羰基-C_1-C_3-烷基、鹵基-(C_1-C_3-烷氧基)羰基-C_1-C_3-烷基；

(C_1-C_6-烷基)羰基、(C_1-C_4-烷氧基)羰基、(C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基)羰基、(C_3-C_6-環烷基)羰基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之(C_1-C_4-鹵烷基)羰基、(C_1-C_4-鹵基烷氧基)羰基、(鹵基-C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基)羰基、(C_3-C_6-鹵基環烷基)羰基；或 -C(=O)C(=O)R^1、-CONR^2R^3 或-$CH_2NR^4R^5$。

R 特佳為代表氫、甲基、乙基、正-或異丙基、正-、異-、第二-或第三丁基、戊基或己基、甲基亞磺醯基、乙基亞磺醯基、正-或異丙基亞磺醯基、正-、異-、第二-或第三丁基亞磺醯基、甲基磺醯基、乙基磺醯基、正-或異丙基磺醯基、正-、異-、第二-或第三丁基磺醯基、甲氧甲基、甲氧乙基、乙氧甲基、乙氧乙基、環丙基、環戊基、環己基、三氟甲基、三氯甲基、三氟乙基、二氟甲硫基、二氟氯甲硫基、三氟甲硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、三氟甲氧甲基；甲醯基、-CH_2-CHO、-$(CH_2)_2$-CHO、

$-CH_2-CO-CH_3$、$-CH_2-CO-CH_2-CH_3$、$-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$、$-(CH_2)_2-CO-CH_3$、$-(CH_2)_2-CO-CH_2CH_3$、$-(CH_2)_2-CO-CH(CH_3)_2$、$-CH_2-CO_2CH_3$、$-CH_2-CO_2CH_2CH_3$、$-CH_2-CO_2CH(CH_3)_2$、$-(CH_2)_2-CO_2CH_3$、$-(CH_2)_2-CO_2CH_2CH_3$、$-(CH_2)_2-CO_2CH(CH_3)_2$、$-CH_2-CO-CF_3$、$-CH_2-CO-CCl_3$、$-CH_2-CO-CH_2CF_3$、$-CH_2-CO-CH_2CCl_3$、$-(CH_2)_2-CO-CH_2CF_3$、$-(CH_2)_2-CO-CH_2CCl_3$、$-CH_2-CO_2CH_2CF_3$、$-CH_2-CO_2CF_2CF_3$、$-CH_2-CO_2CH_2CCl_3$、$-CH_2-CO_2CCl_2CCl_3$、$-(CH_2)_2-CO_2CH_2CF_3$、$-(CH_2)_2-CO_2CF_2CF_3$、$-(CH_2)_2-CO_2CH_2CCl_3$、$-(CH_2)_2-CO_2CCl_2CCl_3$；甲基羰基、乙基羰基、正丙基羰基、異丙基羰基、第三丁基羰基、甲氧羰基、乙氧羰基、第三丁氧羰基、環丙基羰基；三氟甲基羰基、三氟甲氧羰基或$-C(=O)C(=O)R^1$、$-CONR^2R^3$或$-CH_2NR^4R^5$。

R　更特佳為代表氫、甲基、甲氧甲基、甲醯基、$-CH_2-CHO$、$-(CH_2)_2-CHO$、$-CH_2-CO-CH_3$、$-CH_2-CO-CH_2-CH_3$、$-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$、$-C(=O)CHO$、$-C(=O)C(=O)CH_3$、$-C(=O)C(=O)CH_2OCH_3$、$-C(=O)CO_2CH_3$、$-C(=O)CO_2CH_2CH_3$。

R^1　較佳為代表氫、C_1-C_6-烷基、C_1-C_4-烷氧基、C_1-C_3-

烷氧基-C_1-C_3-烷基、C_3-C_6-環烷基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_4-鹵烷基、C_1-C_4-鹵基烷氧基、鹵基-C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基、C_3-C_6-鹵基環烷基。

R^1 特佳為代表氫、甲基、乙基、正-或異丙基、第三丁基、甲氧基、乙氧基、正-或異丙氧基、第三丁氧基、甲氧甲基、環丙基；三氟甲基、三氟甲氧基。

R^2 與 R^3 彼此獨立地較佳為代表氫、C_1-C_6-烷基、C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基、C_3-C_6-環烷基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_4-鹵烷基、鹵基-C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基、C_3-C_6-鹵基環烷基。

R^2 與 R^3 進一步和與其連接之氮原子一起較佳為代表具有 5 或 6 個環原子之飽和雜環，其視需要被得自包括鹵素與 C_1-C_4-烷基之組群之相同或不同取代基單至四取代，其中雜環可含有 1 或 2 個另外之得自包括氧、硫與 NR^6 之組群之不相鄰雜原子。

R^2 與 R^3 彼此獨立地特佳為代表氫、甲基、乙基、正-或異丙基、正-、異-、第二-或第三丁基、甲氧甲基、甲氧乙基、乙氧甲基、乙氧乙基、環丙基、環戊基、環己基；三氟甲基、三氯甲基、三氟乙基、三氟甲氧甲基。

R^2 與 R^3 進一步和與其連接之氮原子一起特佳為形成得自包括嗎啉、硫代嗎啉與六氫吡咔之組群之飽和雜環，該雜環視需要被得自包括氟、氯、溴與甲基之

組群之相同或不同取代基單至四取代，其中六氫吡咁可於第二氮原子上被 R^6 取代。

R^4 與 R^5 彼此獨立地較佳為代表氫、C_1-C_6-烷基、C_3-C_6-環烷基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_4-鹵烷基、C_3-C_6-鹵基環烷基，

R^4 與 R^5 進一步和與其連接之氮原子一起較佳為形成具有 5 或 6 個環原子之飽和雜環，其視需要被得自包括鹵素與 C_1-C_4-烷基之組群之相同或不同取代基單或多取代，其中雜環可含有 1 或 2 個另外之得自包括氧、硫與 NR^6 之組群之不相鄰雜原子。

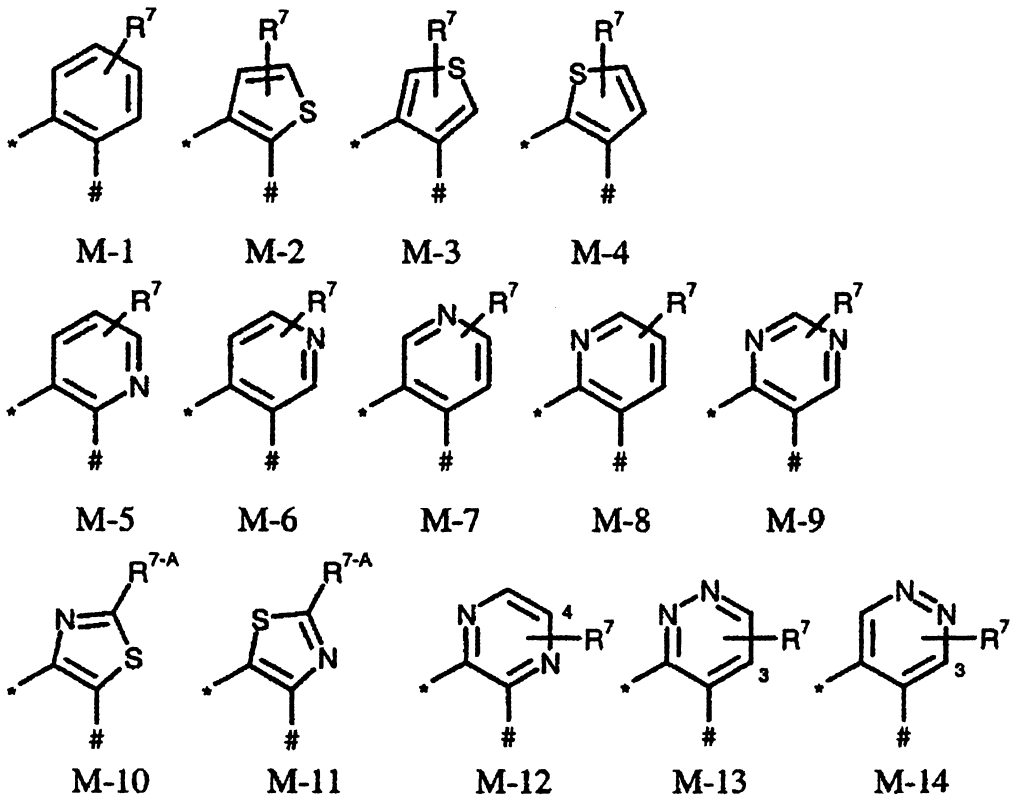
R^4 與 R^5 彼此獨立地特佳為代表氫、甲基、乙基、正-或異丙基、正-、異-、第二-或第三丁基、甲氧甲基、甲氧乙基、乙氧甲基、乙氧乙基、環丙基、環戊基、環己基；三氟甲基、三氯甲基、三氟乙基、三氟甲氧甲基。

R^4 與 R^5 進一步和與其連接之氮原子一起特佳為代表得自包括嗎啉、硫代嗎啉與六氫吡咁之組群之飽和雜環，該雜環視需要被得自包括氟、氯、溴與甲基之組群之相同或不同取代基單至四取代，其中六氫吡咁可於第二氮原子上被 R^6 取代。

R^6 較佳為代表氫或 C_1-C_4-烷基。

R^6 特佳為代表氫、甲基、乙基、正-或異丙基、正-、異-、第二-或第三丁基。

M　較佳為代表下文諸環之一者



，

其中標示「*」之鍵係連接於醯胺；標示「#」之鍵係連接於 Z 基團。

M　特佳為代表選自包括 M-1、M-2、M-3、M-4、M-5、M-6、M-9、M-10 與 M-11 之組群之環。

M　更特佳為代表選自包括 M-1、M-2、M-5、M-6、M-9、M-10 與 M-11 之組群之環。

M　尤其較佳為代表 M-1 環。

M　進一步尤其較佳為代表 M-2 環。

M　進一步尤其較佳為代表 M-5 環。

M　進一步尤其較佳為代表 M-6 環。

M　進一步尤其較佳為代表 M-9 環。

M　進一步尤其較佳為代表 M-10 環。

M　進一步尤其較佳為代表 M-11 環。

R^7　較佳為代表氫。

R^7　進一步地，如果 M 代表 M-1，則較佳為代表氟，其中氟特佳為位於醯替苯胺基團之位置 4、5 或 6，更特佳為位於位置 4 或 6，尤其是位置 4 [參見上文式(I)]。

R^7　進一步地，如果 M 代表 M-1，則較佳為代表氯，其中氯特佳為位於醯替苯胺基團之位置 5 [參見上文式(I)]。

R^7　進一步地，如果 M 代表 M-1，則較佳為代表甲基，其中甲基特佳為位於醯替苯胺基團之位置 3 [參見上文式(I)]。

R^7　進一步地，如果 M 代表 M-1，則較佳為代表三氟甲基，其中三氟甲基特佳為位於醯替苯胺基團之位置 4 或 5 [參見上文式(I)]。

R^7　進一步地，如果 M 代表 M-2、M-3 或 M-4，則較佳為代表氯，其中氯特佳為位於位置 5 (M-2、M-3)或位置 3 (M-4)。

R^7　進一步地，如果 M 代表 M-2、M-3 或 M-4，則較佳為代表甲基，其中甲基特佳為位於位置 5 (M-2、M-3)或位置 3 (M-4)。

R^7　進一步地，如果 M 代表 M-5、M-6、M-7 或 M-8，則較佳為代表氟，其中氟特佳為位於位置 6 (M-5、M-6)或位置 3 (M-7、M-8)。

R^7 進一步地，如果 M 代表 M-5、M-6、M-7 或 M-8，則較佳為代表氯，其中氯特佳為位於位置 6 (M-5、M-6) 或位置 3 (M-7、M-8)。

R^7 進一步地，如果 M 代表 M-5、M-6、M-7 或 M-8，則較佳為代表甲基，其中甲基特佳為位於位置 4 (M-5) 或位置 3 (M-6、M-7、M-8)。

R^7 進一步地，如果 M 代表 M-9，則較佳為代表甲基，其中甲基特佳為位於位置 3。

R^7 進一步地，如果 M 代表 M-9，則較佳為代表三氟甲基，其中三氟甲基特佳為位於位置 3。

R^7 進一步地，如果 M 代表 M-12，則較佳為代表甲基，其中甲基特佳為位於位置 4。

R^7 進一步地，如果 M 代表 M-12，則較佳為代表三氟甲基，其中三氟甲基特佳為位於位置 4。

R^7 進一步地，如果 M 代表 M-13，則較佳為代表甲基，其中甲基特佳為位於位置 3。

R^7 進一步地，如果 M 代表 M-13，則較佳為代表三氟甲基，其中三氟甲基特佳為位於位置 3。

R^7 進一步地，如果 M 代表 M-14，則較佳為代表甲基，其中甲基特佳為位於位置 3。

R^7 進一步地，如果 M 代表 M-14，則較佳為代表三氟甲基，其中三氟甲基特佳為位於位置 3。

R^{7-A} 較佳為代表氫。

R^{7-A} 進一步較佳為代表甲基。

R^{7-A} 進一步較佳為代表三氟甲基。

Z 較佳為代表 Z^1。

Z^1 較佳為代表苯基，其視需要被相同或不同取代基單-至五取代，取代基於各情形下係選自 W^1 所列舉者。

Z^1 特佳為代表單取代之苯基，取代基於各情形下係選自 W^1 所列舉者。

Z^1 亦特佳為代表被相同或不同取代基雙取代之苯基，取代基於各情形下係選自 W^1 所列舉者。

Z^1 亦特佳為代表被相同或不同取代基三取代之苯基，取代基於各情形下係選自 W^1 所列舉者。

Z^1 更特佳為代表於位置 4 被單取代之苯基，取代基於各情形下係選自 W^1 所列舉者。

Z^1 更特佳為代表於 3,4-位置被相同或不同取代基雙取代之苯基，取代基於各情形下係選自 W^1 所列舉者。

Z^1 更特佳為代表於 2,3-位置被相同或不同取代基雙取代之苯基，取代基於各情形下係選自 W^1 所列舉者。

Z^1 更特佳為代表於 2,4-位置被相同或不同取代基雙取代之苯基，取代基於各情形下係選自 W^1 所列舉者。

Z^1 更特佳為代表於 3,5-位置被相同或不同取代基雙取代之苯基，取代基於各情形下係選自 W^1 所列舉者。

Z^1 更特佳為代表於 2,4,6-位置被相同或不同取代基三取代之苯基，取代基於各情形下係選自 W^1 所列舉者。

W^1 代表鹵素、氰基、硝基、胺基、羥基、甲醯基、羧基、胺甲醯基、硫代胺甲醯基；

各具有 1 至 8 個碳原子之各為直鏈或分支鏈之烷基、羥烷基、羰烷基、烷氧基、烷氧烷基、烷硫基烷基、二烷氧烷基、烷硫基、烷基亞磺醯基或烷基磺醯基；

各具有 2 至 6 個碳原子之各為直鏈或分支鏈之烯基或烯基氧基；

各具有 1 至 6 個碳原子及 1 至 13 個相同或不同鹵原子之各為直鏈或分支鏈之鹵烷基、鹵基烷氧基、鹵基烷硫基、鹵烷基亞磺醯基或鹵烷基磺醯基；

各具有 2 至 6 個碳原子及 1 至 11 個相同或不同鹵原子之各為直鏈或分支鏈之鹵烯基或鹵基烯氧基；

於各個烴鏈具有 1 至 6 個碳原子之各為直鏈或分支鏈之烷胺基、二烷胺基、烷羰基、烷羰基氧基、烷氧羰基、烷胺基羰基、二烷胺基羰基、芳烷胺基羰基、二烷胺基羰氧基，於各個烴鏈具有 2 至 6 個碳原子之烯羰基或炔羰基；

各具有 3 至 6 個碳原子之環烷基或環烷基氧基；

具有 3 或 4 個碳原子之於各情形下為雙連接之伸烷基、具有 2 或 3 個碳原子之氧基伸烷基或具有 1 或 2 個碳原子之二氧基伸烷基，各者視需要被得自包括氟、氯、酮基、甲基、三氟甲基與乙基之組群之相同或不同取代基單至四取代；

或 $-C(Q^1)=N-Q^2$ 基團，其中

Q^1 代表氫、羥基或具有 1 至 4 個碳原子之烷基、

具有 1 至 4 個碳原子及 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之鹵烷基或具有 1 至 6 個碳原子之環烷基及

Q^2 代表羥基、胺基、甲胺基、苯基、苄基或代表具有 1 至 4 個碳原子之於各情形下視需要被氰基-、羥基-、烷氧基-、烷硫基-、烷胺基-、二烷胺基-或苯基-取代之具有 1 至 4 個碳原子之烷基或烷氧基，或代表各具有 2 至 4 個碳原子之烯氧基或炔氧基，

以及苯基、苯氧基、苯硫基、苯甲醯基、苯甲醯基乙烯基、肉桂醯基、雜環基或苯基烷基、苯基烷氧基、苯基烷硫基、或雜環烷基，彼等於各個烷基鏈各具有 1 至 3 個碳原子，及各者於環部分視需要被鹵素及/或具有 1 至 4 個碳原子之直鏈或分支鏈烷基或烷氧基單至三取代。

W^1 較佳為代表氟、氯、溴、甲基、乙基、正-或異丙基、正-、異-、第二-或第三丁基、甲氧基、乙氧基、正-或異丙氧基、三氟甲基、三氟乙基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、二氟氯甲氧基、三氟乙氧基、於各情形下為雙連接之二氟伸甲二氧基或四氟伸乙二氧基，

或 $-C(Q^1)=N-Q^2$ 基團，其中

Q^1 代表氫、甲基、乙基或三氟甲基及

Q^2 代表羥基、甲氧基、乙氧基、丙氧基或異丙氧

基。

Z　亦較佳為代表 Z^2。

Z^2　較佳為代表各具有 3 至 10 個碳原子之環烷基或雙環烷基，各者視需要被得自包括鹵素與 C_1-C_4-烷基之組群之相同或不同取代基單-至四取代。

Z^2　特佳為代表環丙基、環戊基、環己基、環庚基、環辛基、環壬基、雙環[2.2.1]庚基或雙環[2.2.2]辛基，各者視需要被得自包括氟與甲基之組群之相同或不同取代基單-至四取代。

Z^2　更特佳為代表被氟-及甲基-取代之環丙基。

Z　亦較佳為代表 Z^3。

Z^3　較佳為代表未經取代之 C_2-C_{20}-烷基或代表 C_1-C_{20}-烷基，其被得自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：氟、氯、溴、碘、C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷氧基、C_1-C_6-烷胺基、二(C_1-C_6-烷基)胺基、C_1-C_6-鹵基烷硫基、C_1-C_6-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_6-鹵烷基磺醯基、C_1-C_6-鹵基烷氧基、C_1-C_6-鹵基烷胺基、鹵基-二(C_1-C_6-烷基)胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$ 與 C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被得自包括氟、氯、溴、碘、C_1-C_4-烷基與 C_1-C_4-鹵烷基之組群之相同或不同取代基單-至四取代。

Z^3　特佳為代表未經取代之 C_2-C_{20}-烷基。

Z^3 亦特佳為代表 C_1-C_{20}-烷基，其被氟、氯、溴、碘、C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_4-烷基亞磺醯基、C_1-C_4-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷氧基、C_1-C_4-烷胺基、二(C_1-C_4-烷基)胺基、各具有1至9個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_4-鹵基烷硫基、C_1-C_4-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、C_1-C_4-鹵基烷氧基、C_1-C_4-鹵基烷胺基、鹵基-二(C_1-C_4-烷基)胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$、環丙基、二氟環丙基、環丁基、環戊基或環己基取代；更特佳為代表 C_1-C_{20}-烷基，其被氟、氯、甲硫基、乙硫基、正-或異丙硫基、正-、異-、第二-、第三丁硫基、戊硫基、己硫基、甲基磺醯基、乙基磺醯基、正-或異丙基磺醯基、正-、異-、第二-、第三丁基磺醯基、甲氧基、乙氧基、正-或異丙氧基、正-、異-、第二-、第三丁氧基、甲胺基、乙胺基、正-或異丙胺基、正-、異-、第二-、第三丁胺基、二甲胺基、二異丙胺基、三氟甲硫基、三氟甲氧基、$-SiR^8R^9R^{10}$、環丙基、二氟環丙基、環丁基、環戊基或環己基取代。

Z 亦較佳為代表 Z^4。

Z^4 較佳為代表 C_2-C_{20}-烯基或 C_2-C_{20}-炔基，各者視需要被得自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：氟、氯、溴、碘、C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷氧基、C_1-C_6-烷胺基、二(C_1-C_6-烷基)胺基、C_1-C_6-鹵基烷硫基、C_1-C_6-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_6-鹵烷基磺醯基、C_1-C_6-鹵基

烷氧基、C_1-C_6-鹵基烷胺基、鹵基-二(C_1-C_6-烷基)胺基、-$SiR^8R^9R^{10}$與C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被得自包括氟、氯、溴、碘、C_1-C_4-烷基與C_1-C_4-鹵烷基之組群之相同或不同取代基單-至四取代。

Z^4 特佳為代表C_2-C_{20}-烯基或C_2-C_{20}-炔基，各者視需要被氟、氯、溴、碘、C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_4-烷基亞磺醯基、C_1-C_4-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷氧基、C_1-C_4-烷胺基、二(C_1-C_4-烷基)胺基、各具有1至9個氟、氯及/或溴原子之C_1-C_4-鹵基烷硫基、C_1-C_4-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、C_1-C_4-鹵基烷氧基、C_1-C_4-鹵基烷胺基、鹵基-二(C_1-C_4-烷基)胺基、-$SiR^8R^9R^{10}$、環丙基、二氯環丙基、環丁基、環戊基或環己基取代。

Z^4 更特佳為代表C_2-C_{20}-烯基或C_2-C_{20}-炔基。

R^8與R^9彼此獨立地較佳為代表C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基或C_1-C_3-烷硫基-C_1-C_3-烷基。

R^8與R^9彼此獨立地特佳為代表甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、甲氧甲基、乙氧甲基、甲氧乙基、乙氧乙基、甲硫基甲基、乙硫基甲基、甲硫基乙基或乙硫基乙基。

R^8與R^9彼此獨立地更特佳為代表甲基、甲氧基、甲氧甲基或甲硫基甲基。

R^8 與 R^9 尤其較佳為各代表甲基。

R^{10} 較佳為代表 C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基、C_1-C_3-烷硫基-C_1-C_3-烷基、C_3-C_6-環烷基、苯基或苄基。

R^{10} 特佳為代表甲基、乙基、正-或異丙基、正-、第二-、異-或第三丁基、甲氧基、乙氧基、正-或異丙氧基、正-、第二-、異-或第三丁氧基、甲氧甲基、乙氧甲基、甲氧乙基、乙氧乙基、甲硫基甲基、乙硫基甲基、甲硫基乙基、乙硫基乙基、環丙基、苯基或苄基。

R^{10} 更特佳為代表甲基、乙基、正-或異丙基、異-或第三丁基、甲氧基、異丙氧基、異-或第三丁氧基、甲氧甲基、甲硫基甲基或苯基。

R^{10} 尤其較佳為代表甲基、乙基、正-或異丙基、異-或第三丁基、甲氧基、異丙氧基、異-或第三丁氧基。

R^{10} 最佳為代表甲基。

M 與 Z 亦較佳為一起代表 1,1,3-三甲基-1H-2,3-二氫茚-4-基、1,3-二甲基-1H-2,3-二氫-茚-4-基、1,1,3-三甲基-1,3-二氫-2-苯並呋喃-4-基、1,3-二甲基-1,3-二氫-2-苯並呋喃-4-基、1,1,3-三甲基-1,3-二氫-2-苯並噻吩-4-基或 1,3-二甲基-1,3-二氫-2-苯並噻吩-4-基。

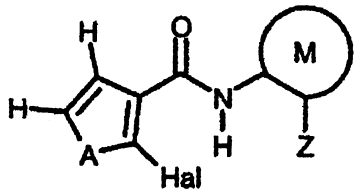
M 與 Z 亦特佳為一起代表 1,1,3-三甲基-1H-2,3-二氫茚-4-基。

較佳者為式(I)中所有基團各具有上文提及的較佳意義之彼等化合物。

特佳者為式(I)中所有基團於各情形下具有上文提及的特佳意義之彼等化合物。

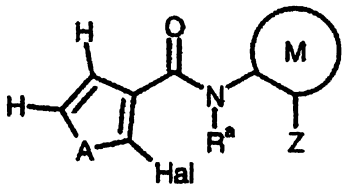
較佳、且於各情形下被瞭解係上文提及的式(I)化合物之子群者，為下述組別之新穎羧醯胺類：

第 1 組： 式(I-b)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



式中 A、Hal、R、M 與 Z 如上文之界定。

第 2 組： 式(I-c)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



(I-c)

式中 A、Hal、R^a、M 與 Z 如上文之界定。

R^a 較佳為代表 C_1-C_6-烷基、C_1-C_4-烷基亞磺醯基、C_1-C_4-烷基磺醯基、C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基、C_3-C_6-環烷基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_4-鹵烷基、C_1-C_4-鹵烷基硫基、C_1-C_4-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基、C_3-C_8-鹵基環烷基；甲醯基、甲醯基-C_1-C_3-烷基、(C_1-C_3-烷基)羰基-C_1-C_3-烷基、(C_1-C_3-烷氧基)羰基

-C_1-C_3-烷基；各具有 1 至 13 個氟、氯及/或溴原子之鹵基-(C_1-C_3-烷基)羰基-C1-C3-烷基、鹵基-(C_1-C_3-烷氧基)羰基-C_1-C_3-烷基；

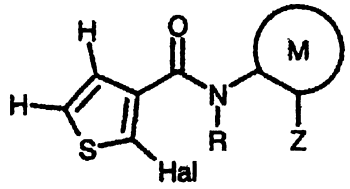
(C_1-C_6-烷基)羰基、(C_1-C_4-烷氧基)羰基、(C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基)羰基、(C_3-C_6-環烷基)羰基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之(C_1-C_4-鹵烷基)羰基、(C_1-C_4-鹵基烷氧基)羰基、(鹵基-C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基)羰基、(C_3-C_6-鹵基環烷基)羰基；或 -C(=O)C(=O)R^1、-CONR^2R^3 或-$CH_2NR^4R^5$。

R^a 特佳為代表甲基、乙基、正-或異丙基、正-、異-、第二-或第三丁基、戊基或己基、甲基亞磺醯基、乙基亞磺醯基、正-或異丙基亞磺醯基、正-、異-、第二-或第三丁基亞磺醯基、甲基磺醯基、乙基磺醯基、正-或異丙基磺醯基、正-、異-、第二-或第三丁基磺醯基、甲氧甲基、甲氧乙基、乙氧甲基、乙氧乙基、環丙基、環戊基、環己基、三氟甲基、三氯甲基、三氟乙基、二氟甲硫基、二氟氯甲硫基、三氟甲硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、三氟甲氧甲基；甲醯基、-CH_2-CHO、-$(CH_2)_2$-CHO、-CH_2-CO-CH_3、-CH_2-CO-CH_2-CH_3、-CH_2-CO-$CH(CH_3)_2$、-$(CH_2)_2$-CO-CH_3、-$(CH_2)_2$-CO-CH_2CH_3、-$(CH_2)_2$-CO-$CH(CH_3)_2$、-CH_2-CO_2CH_3、-CH_2-$CO_2CH_2CH_3$、-CH_2-$CO_2CH(CH_3)_2$、-$(CH_2)_2$-CO_2CH_3、

$-(CH_2)_2-CO_2CH_2CH_3$、$-(CH_2)_2-CO_2CH(CH_3)_2$、$-CH_2-CO-CF_3$、$-CH_2-CO-CCl_3$、$-CH_2-CO-CH_2CF_3$、$-CH_2-CO-CH_2CCl_3$、$-(CH_2)_2-CO-CH_2CF_3$、$-(CH_2)_2-CO-CH_2CCl_3$、$-CH_2-CO_2CH_2CF_3$、$-CH_2-CO_2CF_2CF_3$、$-CH_2-CO_2CH_2CCl_3$、$-CH_2-CO_2CCl_2CCl_3$、$-(CH_2)_2-CO_2CH_2CF_3$、$-(CH_2)_2-CO_2CF_2CF_3$、$-(CH_2)_2-CO_2CH_2CCl_3$、$-(CH_2)_2-CO_2CCl_2CCl_3$；甲基羰基、乙基羰基、正丙基羰基、異丙基羰基、第三丁基羰基、甲氧羰基、乙氧羰基、第三丁氧羰基、環丙基羰基；三氟甲基羰基、三氟甲氧羰基或$-C(=O)C(=O)R^1$、$-CONR^2R^3$或$-CH_2NR^4R^5$。

R^a 更特佳為代表甲基、甲氧甲基、甲醯基、$-CH_2-CHO$、$-(CH_2)_2-CHO$、$-CH_2-CO-CH_3$、$-CH_2-CO-CH_2-CH_3$、$-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$、$-C(=O)CHO$、$-C(=O)C(=O)CH_3$、$-C(=O)C(=O)CH_2OCH_3$、$-C(=O)CO_2CH_3$、$-C(=O)CO_2CH_2CH_3$。

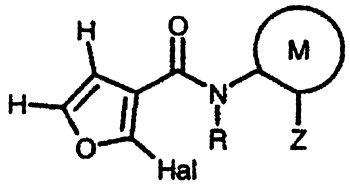
第 3 組： 式(I-d)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



(I-d)

式中 Hal、R、M 與 Z 如上文之界定。

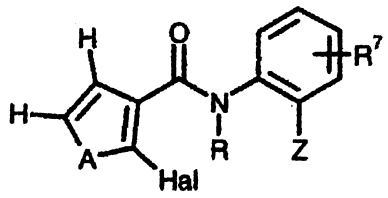
第 4 組： 式(I-e)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



(I-e)

式中 Hal、R、M 與 Z 如上文之界定。

第 5 組： 式(I-f)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



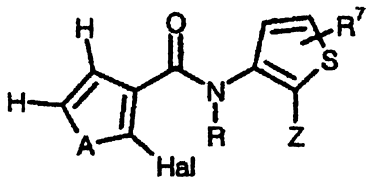
(I-f)

式中 A、Hal、R、R^7 與 Z 如上文之界定。

較佳者為式(I-f)化合物中 A 代表 S (硫)者。

較佳者進一步為式(I-f)化合物中 A 代表 O (氧)者。

第 6 組： 式(I-f)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



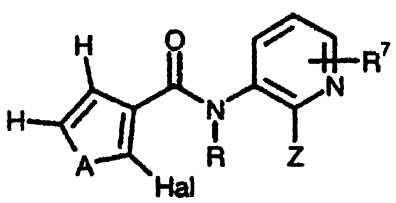
(I-g)

式中 A、Hal、R、R^7 與 Z 如上文之界定。

較佳者為式(I-g)化合物中 A 代表 S (硫)者。

較佳者進一步為式(I-g)化合物中 A 代表 O (氧)者。

第 7 組： 式(I-h)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



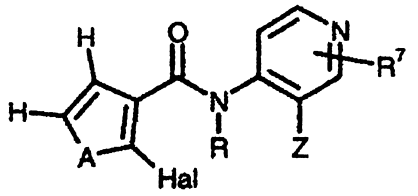
(I-h)

式中 A、Hal、R、R^7 與 Z 如上文之界定。

較佳者為式(I-h)化合物中 A 代表 S (硫)者。

較佳者進一步為式(I-h)化合物中 A 代表 O (氧)者。

第 8 組： 式(I-i)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



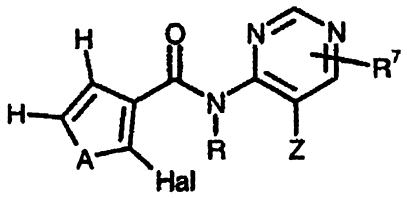
(I-i)

式中 A、Hal、R、R^7與 Z 如上文之界定。

較佳者為式(I-i)化合物中 A 代表 S (硫)者。

較佳者進一步為式(I-i)化合物中 A 代表 O (氧)者。

第 9 組： 式(I-j)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



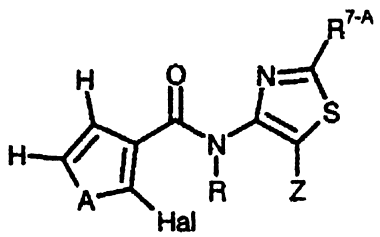
(I-j)

式中 A、Hal、R、R^7與 Z 如上文之界定。

較佳者為式(I-j)化合物中 A 代表 S (硫)者。

較佳者進一步為式(I-j)化合物中 A 代表 O (氧)者。

第 10 組： 式(I-k)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



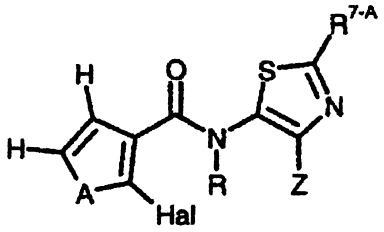
(I-k)

式中 A、Hal、R、R^7與 Z 如上文之界定。

較佳者為式(I-k)化合物中 A 代表 S (硫)者。

較佳者進一步為式(I-k)化合物中 A 代表 O (氧)者。

第 11 組： 式(I-l)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



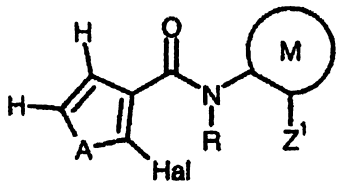
(I-l)

式中 A、Hal、R、R^7 與 Z 如上文之界定。

較佳者為式(I-l)化合物中 A 代表 S (硫)者。

較佳者進一步為式(I-l)化合物中 A 代表 O (氧)者。

第 12 組： 式(I-m)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



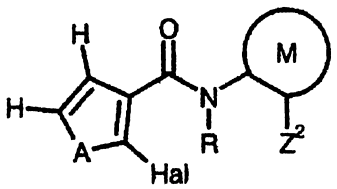
(I-m)

式中 A、Hal、R、M 與 Z^1 如上文之界定。

較佳者為式(I-m)化合物中 A 代表 S (硫)者。

較佳者進一步為式(I-m)化合物中 A 代表 O (氧)者。

第 13 組： 式(I-n)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



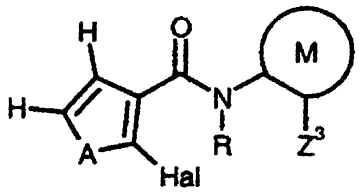
(I-n)

式中 A、Hal、R、M 與 Z^2 如上文之界定。

較佳者為式(I-n)化合物中 A 代表 S (硫)者。

較佳者進一步為式(I-n)化合物中 A 代表 O (氧)者。

第 14 組： 式(I-o)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



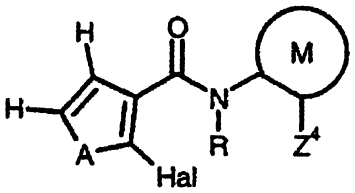
(I-o)

式中 A、Hal、R、M 與 Z^3 如上文之界定。

較佳者為式(I-o)化合物中 A 代表 S (硫)者。

較佳者進一步為式(I-o)化化合物中 A 代表 O (氧)者。

第 15 組： 式(I-p)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



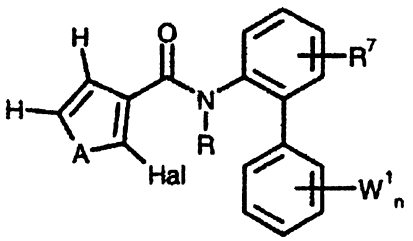
(I-p)

式中 A、Hal、R、M 與 Z^4 如上文之界定。

較佳者為式(I-p)化合物中 A 代表 S (硫)者。

較佳者進一步為式(I-p)化合物中 A 代表 O (氧)者。

第 16 組： 式(I-q)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



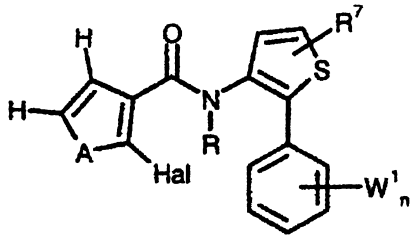
(I-q)

式中 A、Hal、R、R^7 與 W^1 如上文之界定，n 代表 0、1、2、3、4 或 5，其中若 n 代表 2、3、4 或 5，則諸取代基 W^1 可相同或不同。

較佳者為式(I-q)化合物中 A 代表 S (硫)者。

較佳者進一步為式(I-q)化合物中 A 代表 O (氧)者。

第 17 組： 式(I-r)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



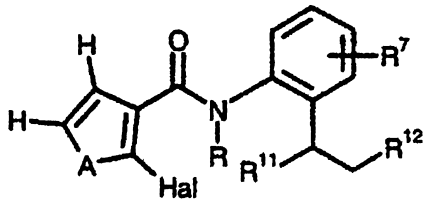
(I-r)

式中 A、Hal、R、R^7 與 W^1 如上文之界定，n 代表 0、1、2、3、4 或 5，其中若 n 代表 2、3、4 或 5，則諸取代基 W^1 可相同或不同。

較佳者為式(I-r)化合物中 A 代表 S (硫)者。

較佳者進一步為式(I-r)化合物中 A 代表 O (氧)者。

第 18 組： 式(I-s)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



(I-s)

式中 A、Hal、R 與 R^7 如上文之界定，

R^{11} 代表氫或甲基，

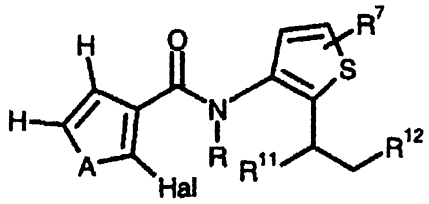
R^{12} 代表-$SiR^8R^9R^{10}$，其中 R^8、R^9 與 R^{10} 如上文之界定，或代表-$CR^{13}R^{14}R^{15}$，其中 R^{13} 代表氟、氯、溴、碘、C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷基亞磺醯基、C_1-C_4-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷氧基、C_1-C_4-烷胺基、二(C_1-C_4-烷基)胺基、C_1-C_4-鹵烷基、C_1-C_4-鹵烷基硫基、C_1-C_4-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、C_1-C_4-鹵基烷

氧基、C_1-C_4-鹵基烷胺基或鹵基-二(C_1-C_4-烷基)胺基，及R^{14}與R^{15}彼此獨立地代表氫、氟、氯、溴、碘、C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷基亞磺醯基、C_1-C_4-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷氧基、C_1-C_4-烷胺基、二(C_1-C_4-烷基)胺基、C_1-C_4-鹵烷基硫基、C_1-C_4-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、C_1-C_4-鹵基烷氧基、C_1-C_4-鹵基烷胺基或鹵基-二(C_1-C_4-烷基)胺基。

較佳者為式(I-s)化合物中 A 代表 S (硫)者。

較佳者進一步為式(I-s)化合物中 A 代表 O (氧)者。

第 19 組： 式(I-t)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



(I-t)

式中 A、Hal、R 與R^7如上文之界定，

R^{11} 代表氫或甲基，

R^{12} 代表-$SiR^8R^9R^{10}$，其中R^8、R^9與R^{10}如上文之界定，或代表-$CR^{13}R^{14}R^{15}$，其中R^{13}代表氟、氯、溴、碘、C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷基亞磺醯基、C_1-C_4-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷氧基、C_1-C_4-烷胺基、二(C_1-C_4-烷基)胺基、C_1-C_4-鹵烷基、C_1-C_4-鹵烷基硫基、C_1-C_4-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、C_1-C_4-鹵基烷氧基、C_1-C_4-鹵基烷胺基或鹵基-二(C_1-C_4-烷基)胺基，及R^{14}與R^{15}彼此獨立地代表氫、氟、氯、溴、碘、C_1-C_4-烷硫基、C_1-C_4-烷基亞磺醯基、C_1-C_4-烷

基磺醯基、C_1-C_4-烷氧基、C_1-C_4-烷胺基、二(C_1-C_4-烷基)胺基、C_1-C_4-鹵烷基硫基、C_1-C_4-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、C_1-C_4-鹵基烷氧基、C_1-C_4-鹵基烷胺基或鹵基-二(C_1-C_4-烷基)胺基。

較佳者為式(I-t)化合物中 A 代表 S (硫)者。

較佳者進一步為式(I-t)化合物中 A 代表 O (氧)者。

最佳者為式(I)(以及第 1 至 19 組)化合物中 R 代表氫者。

最佳者為式(I)(以及第 1 至 19 組)化合物中 R 代表甲醯基者。

最佳者進一步為式(I)(以及第 1 至 19 組)化合物中 R 代表 -C(=O)C(=O)R^1，其中 R^1 如上文之界定者。

飽和或不飽和烴鏈，例如烷基或烯基，可要可能，包括與雜原子之組合，例如，烷氧基中，於各情形下可為直鏈或分支鏈。

C_1-C_{20}-烷基之界定為本文所界定的烷基基團之最大範圍。詳言之，此界定包含意指甲基、乙基、正-、異丙基、正-、異-、第二-、第三丁基及於各情形下所有異構物型之戊基、己基、庚基、辛基、壬基、癸基、十一基、十二基、十三基、十四基、十五基、十六基、十七基、十八基、十九基與二十基。較佳範圍為 C_2-C_{12}-烷基，例如乙基及直鏈或分支鏈丙基、丁基、戊基、己基、庚基、辛基、壬基、癸基、十一基與十二基，特別是直鏈或分支鏈 C_3-C_{10}-烷

基，例如丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、正戊基、1-甲基-丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、1,2-二甲基丙基、1,1-二甲基丙基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、正己基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1-乙基-3-甲基丙基、正庚基、1-甲基己基、1-乙基戊基、2-乙基戊基、1-丙基丁基、辛基、1-甲基庚基、2-甲基庚基、1-乙基己基、2-乙基己基、1-丙基戊基、2-丙基戊基、壬基、1-甲基辛基、2-甲基辛基、1-乙基庚基、2-乙基庚基、1-丙基己基、2-丙基己基、癸基、1-甲基壬基、2-甲基壬基、1-乙基辛基、2-乙基辛基、1-丙基庚基與2-丙基庚基，特別是丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、1,1-二甲基乙基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、戊基、1-甲基丁基、1-乙基丙基、己基、3-甲基戊基、庚基、1-甲基己基、1-乙基-3-甲基丁基、1-甲基庚基、1,2-二甲基己基、1,3-二甲基辛基、4-甲基辛基、1,2,2,3-四甲基丁基、1,3,3-三甲基丁基、1,2,3-三甲基丁基、1,3-二甲基戊基、1,3-二甲基己基、5-甲基-3-己基、2-甲基-4-庚基、2,6-二甲基-4-庚基與1-甲基-2-環丙基乙基。

鹵基取代之烷基代表，例如，氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯

氟甲基、氯二氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟-乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基、3-氯-1-甲基丁基、2-氯-1-甲基丁基、1-氯丁基、3,3-二氯-1-甲基丁基、3-氯-1-甲基丁基、1-甲基-3-三氟甲基丁基、3-甲基-1-三氟甲基丁基。

取代基-$SiR^8R^9R^{10}$ 較佳為代表下述基團：$SiMe_3$、$SiMe_2Et$、$SiMe_2CHMe_2$、$SiMe_2CH_2CHMe_2$、$SiMe_2CH_2CMe_3$、$SiMe_2OCHMe_2$、$SiMe_2OCH_2CHMe_2$、$SiMe_2OMe$、$SiMe_2CMe_3$、$SiMe_2CH_2CH_2Me$。

C_2-C_{20}-烯基之界定為本文所界定的烯基基團之最大範圍。詳言之，此界定包含意指乙烯基、正-、異丙烯基、正-、異-、第二-、第三丁烯基、及於各情形下所有異構物型之戊烯基、己烯基、庚烯基、辛烯基、壬烯基、癸烯基、十一烯基、十二烯基、十三烯基、十四烯基、十五烯基、十六烯基、十七烯基、十八烯基、十九烯基與二十烯基、1-甲基-1-丙烯基、1-乙基-1-烯丁基、2,4-二甲基-1-戊烯基、2,4-二甲基-2-戊烯基。

C_2-C_{20}-炔基之界定為本文所界定的炔基基團之最大範圍。詳言之，此界定包含意指乙炔基、正-、異丙炔基、正-、異-、第二-、第三丁炔基、及於各情形下所有異構物型之戊炔基、己炔基、庚炔基、辛炔基、壬炔基、癸炔基、十一炔基、十二炔基、十三炔基、十四炔基、十五炔基、十六炔基、十七炔基、十八炔基、十九炔基與二十炔基。

視需要經取代之基團可為單或多取代，於多取代之情形下，諸取代基可相同或不同。因此，二烷胺基之界定亦包含被烷基不對稱取代之胺基，例如，甲基乙胺基。

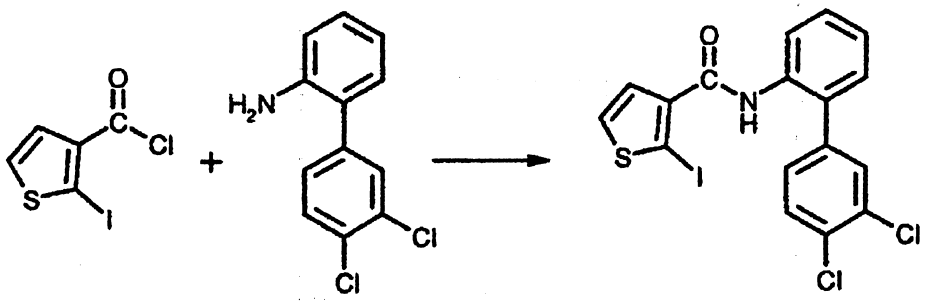
經鹵素取代之基團，例如，鹵烷基，係經單或多鹵化。於多鹵化之情形下，該等鹵原子可相同或不同。此處，鹵素代表氟、氯、溴與碘，特別是氟、氯與溴。

上文所示概括性或較佳之基團界定或說明可依需要於各別範圍與較佳範圍間組合，此亦運用於終產物及，對映地，前驅體與中間產物。特別是，第 1 至 18 組中述及之化合物可與概括性及較佳意義等(特別是較佳意義)組合，又，諸較佳範圍間之任何組合均屬可能。舉例而言，式(I-d)中之 Hal 與 Z 具有概括性意義，而 R 具有較佳之意義及 M 具有特佳之意義。

製法及中間產物說明:

製法(a)

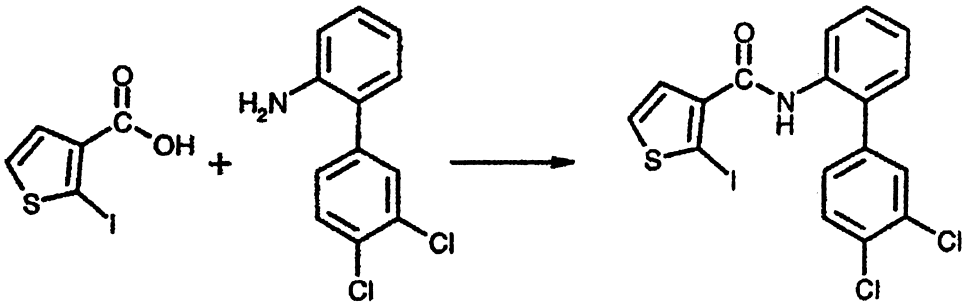
以 2-碘噻吩-3-羰基氯及 3',4'-二氯-1,1'-聯二苯-2-胺為起始物質，根據製法(a)之途徑可由下文反應圖式說明。



式(II)提供作為施行根據本發明製法(a)起始物質用之所需羧酸衍生物之概括性界定。於此式(II)中，A 與 Hal 較佳、特佳及更特佳為具有根據本發明式(I)化合物之相關

說明中分別為彼等基團之較佳、特佳及更特佳者所述及之彼等意義。X^1較佳為代表氯或羥基。

於偶聯劑[例如，二環己基碳化二亞胺，或於原位產生醯基鹵化物，例如使用 PyBrop (六氟磷酸溴-參-吡咯烷鏻)或草醯氯]存在下，以 2-碘噻吩-3-羧酸及 3',4'-二氯-1,1'-聯二苯-2-胺為起始物質，根據製法(a)之途徑可由下文反應圖式說明。



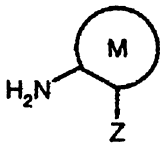
式(II)之羧酸衍生物係已知及/或可利用已知方法(Heterocycles 1993, 36, 1867)予以製備。

式(III)提供作為施行根據本發明製法(a)起始物質用之進一步所需苯胺衍生物之概括性界定。於此式(III)中，R、M與Z較佳、特佳及更特佳為具有根據本發明式(I)化合物之相關說明中分別為彼等基團之較佳、特佳及更特佳者所述及之彼等意義。

多數式(III)起始物質係已知及/或可利用已知方法予以製備(參考，例如，

Bull. Korean Chem. Soc. 2000, 21, 165-166; Chem. Pharm. Bull. 1992, 40, 240-244; Heterocycles 1989, 29, 1013-1016; J. Med. Chem. 1996, 39, 892-903; Synthesis 1995, 713-16; Synth. Commun. 1994, 24, 267-272; Synthesis 1994, 142-144; DE-A 27 27 416; EP-A 0 824 099; EP-A 0 737 682, WO 93/11117, WO 03/080628; EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301, EP-A 0 589 313 and WO 02/38542)。

亦可先行製備式(III-a)之苯胺衍生物



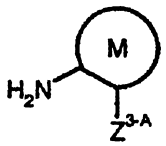
(III-a)

式中 M 與 Z 如上文之界定，接著，適當時，於鹼存在下及於稀釋劑存在下，使彼等化合物與式(XIII)之鹵化物反應 [同樣應用根據本發明製法(i)之反應條件]。

$$R^a—X^6 \qquad (XIII)$$

式中 R^a 與 X^6 如上文之界定。

式(III-b)之苯胺衍生物



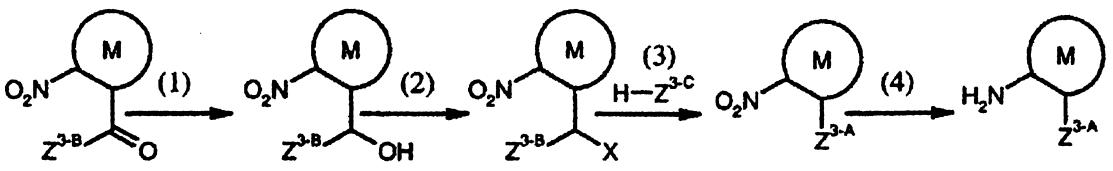
(III-b)

式中

M 如上文之界定及

Z^{3-A} 代表 C_1-C_{20}-烷基，其被烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、鹵基烷硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基、鹵基二烷胺基單取代，

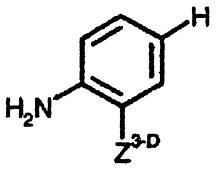
舉例而言，係根據下文反應圖式 1 製得：



於此反應圖式 1 中，Z^{3-A} 如上文之界定，Z^{3-B} 代表未經取代之 C_2-C_{20}-烷基，Z^{3-C} 代表烷硫基、烷基亞磺醯基、

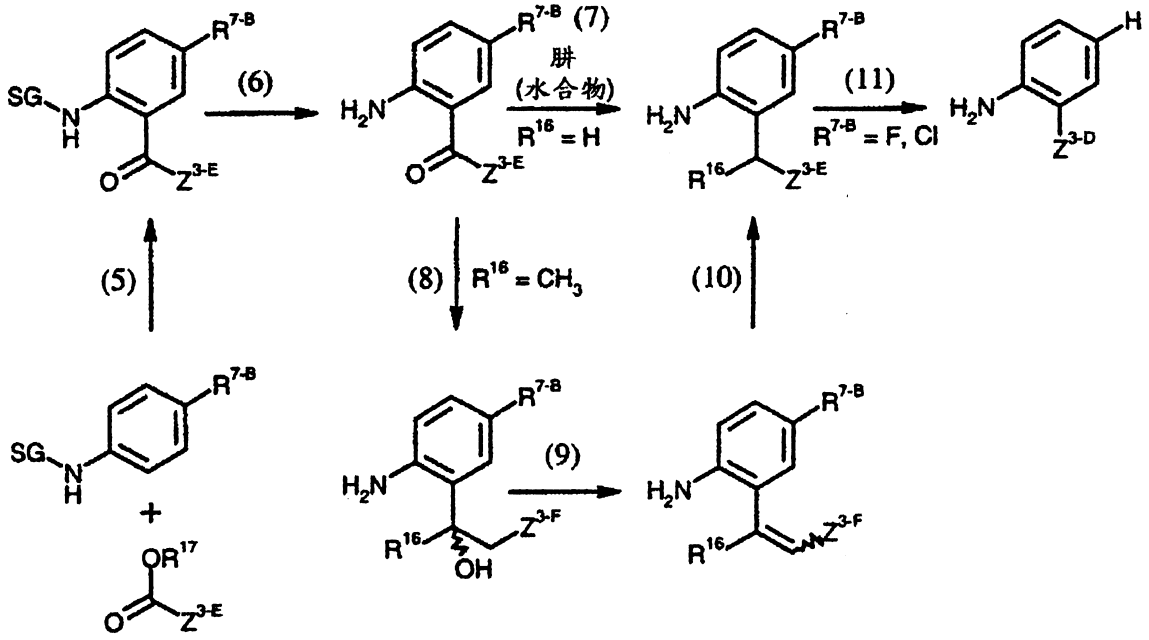
烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、鹵基烷硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基或鹵基二烷胺基。X代表氯、溴或碘。Z^3所示之較佳範圍同樣應用於此處涉及之意義。

式(III-c)之苯胺衍生物



(III-c)

式中Z^{3-D}代表C_1-C_{20}-烷基，其被鹵素單或多取代，舉例而言，係根據下文反應圖式2製得：



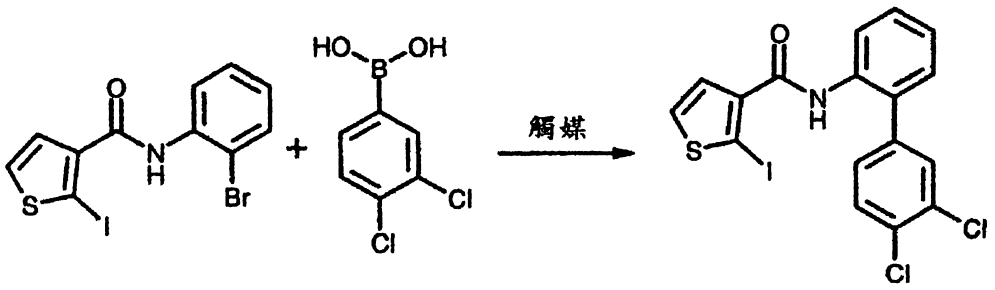
於此反應圖式2中，Z^{3-D}如上文之界定。Z^{3-E}代表被鹵素單或多取代之C_1-C_{19}-烷基。Z^{3-F}代表被鹵素單或多取代之C_1-C_{17}-烷基。R^{7-B}代表氟、氯、甲基、異丙基、甲硫基或三氟甲基。R^{16}代表氫或甲基。SG代表保護基，較佳為Piv(第三丁基羰基)、Boc(第三丁氧基羰基-)、Cbz(苄

基氧羰基-)、三氟乙醯基、Fmoc (9-芴基甲氧羰基-)或 Troc (2,2,2-三氯乙氧羰基-)。R^{17} 代表 C_1-C_4-烷基，較佳為甲基或乙基。

Z^3 與 R^7 所示之較佳範圍同樣應用於此處涉及之意義。

製法(b)

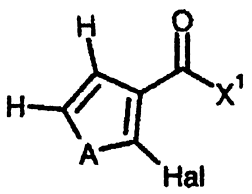
以 N-(2-溴苯基)-2-碘噻吩-3-羧醯胺及 3',4'-二氯苯基硼酸為起始物質，根據製法(b)之途徑可由下文反應圖式說明。



式(IV)提供作為施行根據本發明製法(b)起始物質用之所需鹵基羧醯胺類之概括性界定。於此式(IV)中，A、Hal、R 與 M 較佳、特佳及更特佳為具有根據本發明式(I)化合物之相關說明中分別為彼等基團之較佳、特佳及更特佳者所述及之彼等意義。X^2 較佳為代表溴或碘。

式(IV)之鹵基羧醯胺類迄今尚未被揭示。彼等為新穎化合物，亦形成本申請案之部分主題，其製法為

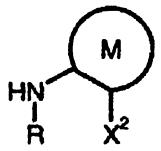
j) 使式(II)之羧酸衍生物



(II)

式中 A、Hal 與 X^1 如上文之界定，

適當時於觸媒存在下、適當時於縮合劑存在下、適當時於酸結合劑存在下及適當時於稀釋劑存在下，與式(XIV)之鹵基苯胺類反應



(XIV)

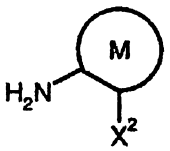
式中 R、M 與 X^2 如上文之界定。

作為施行根據本發明製法(j)起始物質用所需之式(II)羧酸衍生物已於根據本發明製法(a)中有相關之敘述。

式(XIV)提供作為施行根據本發明製法(j)起始物質用之進一步所需鹵基苯胺類之概括性界定。於此式(XIV)中，R、M 與 X^2 較佳、特佳及更特佳為具有根據本發明式(I)化合物或式(III)前驅體之相關說明中分別為彼等基團之較佳、特佳及更特佳者所述及之彼等意義。

式(XIV)之鹵基苯胺類為供合成用之市售可得之化學藥劑或可利用已知方法予以製備。

亦可先行製備式(XIV-a)之鹵基苯胺類



(XIV-a)

式中 M 與 X^2 如上文之界定，接著，適當時，於鹼存在下及於稀釋劑存在下，使彼等化合物與式(XIII)之鹵化物反應[同樣應用根據本發明製法(i)之反應條件]。

$$R^a—X^6 \qquad (XIII)$$

式中 R^a 與 X^6 如上文之界定。

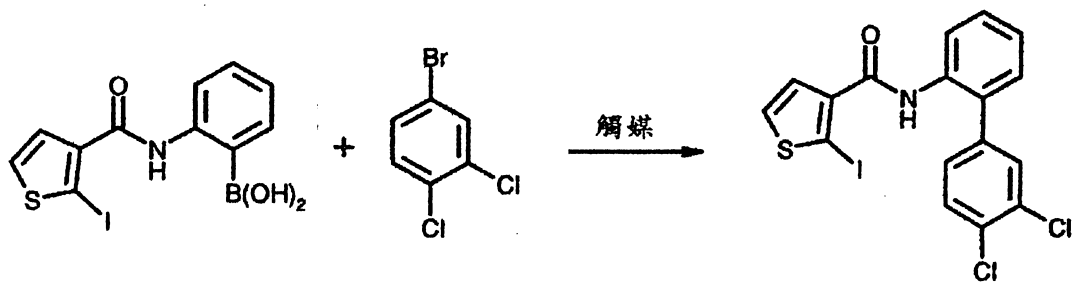
式(V)提供作為施行根據本發明製法(b)起始物質用之

進一步所需硼酸衍生物之概括性界定。於此式(V)中，Z^1較佳、特佳及更特佳為具有根據本發明式(I)化合物之相關說明中分別為彼等基團之較佳、特佳及更特佳者所述及之彼等意義。G^1與G^2各代表氫或一起代表四甲基伸乙基。

式(V)之硼酸衍生物係已知及/或可利用已知方法予以製備(參考，例如，WO 01/90084 與 US 5,633,218)。

製法(c)

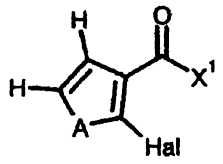
以(2-{[(2-碘-3-噻吩基)羰基]胺基}苯基)硼酸及 4-溴-1,2-二氯苯為起始物質，根據製法(c)之途徑可由下文反應圖式說明。



式(VI)提供作為施行根據本發明製法(c)起始物質用之所需硼酸衍生物之概括性界定。於此式(VI)中，A、Hal、R與M較佳、特佳及更特佳為具有根據本發明式(I)化合物之相關說明中分別為彼等基團之較佳、特佳及更特佳者所述及之彼等意義。G^3與G^4各代表氫或一起代表四甲基伸乙基。

式(VI)之硼酸衍生物迄今尚未被揭示。彼等為新穎化合物，亦形成本申請案之部分主題，其製法為

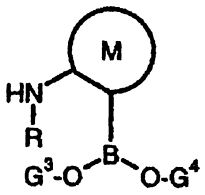
k) 使式(II)之羧酸衍生物



(II)

式中 A、Hal 與 X^1 如上文之界定，

適當時於觸媒存在下、適當時於縮合劑存在下、適當時於酸結合劑存在下及適當時於稀釋劑存在下，與式(XV)之苯胺酮酸衍生物反應



(XV)

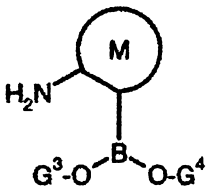
式中 R、M、G^3 與 G^4 如上文之界定。

作為施行根據本發明製法(k)起始物質用所需之式(II)羧酸衍生物已於根據本發明製法(a)中有相關之敘述。

式(XV)提供作為施行根據本發明製法(k)起始物質用之進一步所需苯胺酮酸衍生物之概括性界定。於此式(XV)中，R 與 M 較佳、特佳及更特佳為具有根據本發明式(I)化合物之相關說明中分別為彼等基團之較佳、特佳及更特佳者所述及之彼等意義。G^3 與 G^4 各代表氫或一起代表四甲基伸乙基。

式(XV)之苯胺酮酸衍生物為供合成用之已知化學藥劑或可利用已知方法予以製備。

亦可先行製備式(XV-a)之苯胺酮酸衍生物



(XV-a)

式中 M、G^3 與 G^4 如上文之界定，接著，適當時，於鹼存在下及於稀釋劑存在下，使彼等化合物與式(XIII)之鹵化物反應[同樣應用根據本發明製法(i)之反應條件]。

$$R^a—X^6 \qquad (XIII)$$

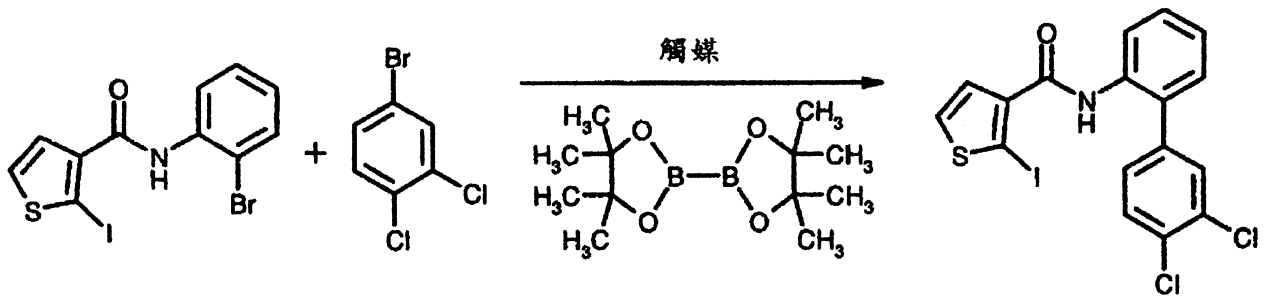
式中 R^a 與 X^6 如上文之界定。

式(VII)提供作為施行根據本發明製法(c)起始物質用之進一步所需苯基衍生物之概括性界定。於此式(VII)中，Z^1 較佳、特佳及更特佳為具有根據本發明式(I)化合物之相關說明中分別為彼等基團之較佳、特佳及更特佳者所述及之彼等意義。X^3 代表氯、溴、碘或三氟甲基磺酸根。

式(VII)之苯基衍生物為供合成用之已知化學藥劑。

製法(d)

以 N-(2-溴苯基)-2-噻吩-3-羧醯胺與 4-溴-1,2-二氯苯為起始物質，及觸媒與 4,4,4',4',5,5,5',5'-八甲基-2,2'-雙-1,3,2-二哼硼茂烷，根據製法(d)之途徑可由下文反應圖式說明。



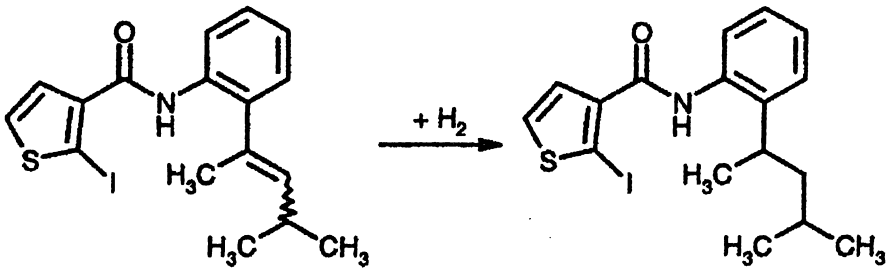
作為施行根據本發明製法(d)起始物質用所需之式(IV)

鹵基羧醯胺類，及式(VII)之苯基衍生物，已於根據本發明製法(b)與(c)中有相關之敘述。

施行根據本發明製法(d)進一步所需之4,4,4',4',5,5,5',5'-八甲基-2,2'-雙-1,3,2-二哼硼茂烷為供合成用之市售可得之化學藥劑。

製法(e)

根據製法(e)之途徑，例如，N-[2-(1,3-二甲基丁-1-烯-1-基)苯基]-2-碘噻吩-3-羧醯胺之氫化反應，可由下文反應圖式說明。



式(I-a)提供作為施行根據本發明製法(e)起始物質用之所需 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類之概括性界定。於此式(I-a)中，A、Hal、R與M較佳、特佳及更特佳為具有根據本發明式(I)化合物之相關說明中分別為彼等基團之較佳、特佳及更特佳者所述及之彼等意義。

X^4 較佳為代表 C_2-C_{20}-烯基或 C_2-C_{20}-炔基，各者視需要被得自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：氟、氯、溴、碘、C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷氧基、C_1-C_6-烷胺基、二(C_1-C_6-烷基)胺基、C_1-C_6-鹵基烷硫基、C_1-C_6-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_6-鹵烷基磺醯基、C_1-C_6-鹵基

烷氧基、C_1-C_6-鹵基烷胺基、鹵基-二(C_1-C_6-烷基)胺基、-$SiR^8R^9R^{10}$與C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被得自包括氟、氯、溴、碘、C_1-C_4-烷基與C_1-C_4-鹵烷基之組群之相同或不同取代基單-至四取代。

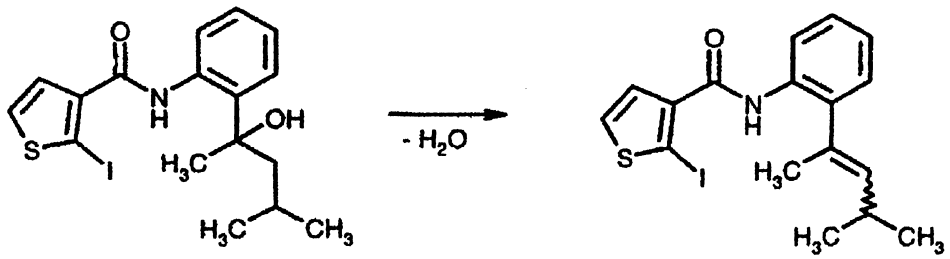
X^4 特佳為代表C_2-C_{20}-烯基或C_2-C_{20}-炔基，各者視需要被氟、氯、溴、碘、C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_4-烷基亞磺醯基、C_1-C_4-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷氧基、C_1-C_4-烷胺基、二(C_1-C_4-烷基)胺基、各具有1至9個氟、氯及/或溴原子之C_1-C_4-鹵基烷硫基、C_1-C_4-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、C_1-C_4-鹵基烷氧基、C_1-C_4-鹵基烷胺基、鹵基-二(C_1-C_4-烷基)胺基、-$SiR^8R^9R^{10}$、環丙基、二氯環丙基、環丁基、環戊基或環己基取代。

X^4 更特佳為代表C_2-C_{20}-烯基或C_2-C_{20}-炔基。

式(I-a)化合物為根據本發明之化合物，可利用根據本發明之製法(a)、(f)、(g)或(h)予以製備。

製法(f)

根據製法(f)之途徑，例如，N-[2-(1-羥基-1,3-二甲基丁基)苯基]-2-碘噻吩-3-羧醯胺之脫水反應，可由下文反應圖式說明。



式(VIII)提供作為施行根據本發明製法(f)起始物質用之所需羥烷基羧醯胺類之概括性界定。於此式(VIII)中，A、Hal、R與M較佳、特佳及更特佳為具有根據本發明式(I)化合物之相關說明中分別為彼等基團之較佳、特佳及更特佳者所述及之彼等意義。

X^5 較佳為代表 C_2-C_{12}-羥烷基，其視需要被得自下述組群之相同或不同取代基單-至四取代：氟、氯、溴、碘、C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷氧基、C_1-C_6-烷胺基、二(C_1-C_6-烷基)胺基、C_1-C_6-鹵基烷硫基、C_1-C_6-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_6-鹵烷基磺醯基、C_1-C_6-鹵基烷氧基、C_1-C_6-鹵基烷胺基、鹵基-二(C_1-C_6-烷基)胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$與C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或C_1-C_4-烷基取代。

X^5 特佳為代表於各情形下為直鏈或分支鏈之羥乙基、羥丙基、羥丁基、羥戊基、羥己基、羥庚基、羥辛基、羥壬基或羥癸基，各者可於任何位置連接及視需要被得自下述組群之相同或不同取代基單-至四取代：氟、氯、溴、碘、C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_4-烷基亞磺醯基、C_1-C_4-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷氧基、C_1-C_4-

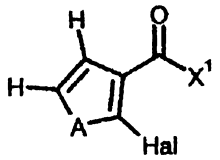
烷胺基、二(C_1-C_4-烷基)胺基、各具有1至9個氟、氯及/或溴原子之C_1-C_4-鹵基烷硫基、C_1-C_4-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、C_1-C_4-鹵基烷氧基、C_1-C_4-鹵基烷胺基、鹵基-二(C_1-C_4-烷基)胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$、環丙基、二氯環丙基、環丁基、環戊基與環己基。

式(VIII)之化合物迄今尚未被揭示，彼等為新穎化合物，亦形成本申請案之部分主題。

頃亦發現式(VIII)之羥烷基吡唑基羧醯胺類具有很好的殺微生物性質，可於作物保護及原料保護上作為防治有害微生物之用。

(VIII)羥烷基吡唑基羧醯胺類之製法為

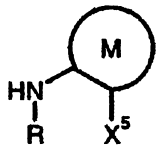
l) 使式(II)之羧酸衍生物



(II)

式中A、Hal與X^1如上文之界定，

適當時於觸媒存在下、適當時於縮合劑存在下、適當時於酸結合劑存在下及適當時於稀釋劑存在下，與式(XVI)之羥烷基苯胺衍生物反應



(XVI)

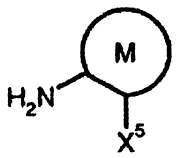
式中R、M與X^5如上文之界定。

作為施行根據本發明製法(l)起始物質用所需之式(II)羧酸衍生物已於根據本發明製法(a)中有相關之敘述。

式(XVI)提供作為施行根據本發明製法(l)起始物質用之進一步所需羥烷基苯胺衍生物之概括性界定。於此式(XVI)中，R、M 與 X^5 較佳、特佳及更特佳為具有根據本發明式(I)與(VIII)諸化合物相關說明中分別為彼等基團之較佳、特佳及更特佳者所述及之彼等意義。

式(XVI)之羥烷基苯胺衍生物係已知及/或可利用已知方法製得(參見，例如，US 3,917,592 或 EP-A 0 824 099)。

亦可先行製備式(XVI-a)之羥烷基苯胺衍生物



(XVI-a)

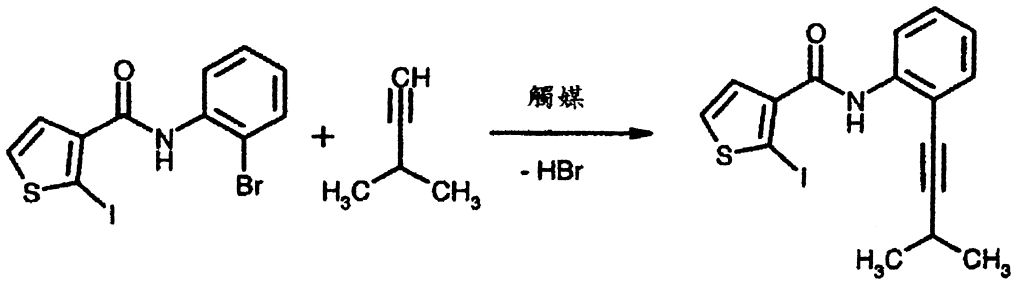
式中 M、與 X^5 如上文之界定，接著，適當時，於鹼存在下及於稀釋劑存在下，使彼等化合物與式(XIII)之鹵化物反應[同樣應用根據本發明製法(i)之反應條件]。

$$R^a—X^6 \qquad (XIII)$$

式中 R^a 與 X^6 如上文之界定。

製法(g)

使用，例如，N-(2-溴苯基)-2-噻吩-3-羧醯胺與 3-甲基丁-1-炔為起始物質及觸媒，根據製法(g)之途徑可由下文反應圖式說明。



作為施行根據本發明製法(g)起始物質用所需之式(IV)鹵基羧醯胺類已於根據本發明製法(c)中有相關之敘述。

式(IX)提供作為施行根據本發明製法(g)起始物質用之進一步所需炔烴類之概括性界定。

G^5 較佳為代表 C_2-C_{12}-烷基，其視需要被得自下述組群之相同或不同取代基單-至四取代：氟、氯、溴、碘、C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷氧基、C_1-C_6-烷胺基、二(C_1-C_6-烷基)胺基、C_1-C_6-鹵基烷硫基、C_1-C_6-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_6-鹵烷基磺醯基、C_1-C_6-鹵基烷氧基、C_1-C_6-鹵基烷胺基、鹵基-二(C_1-C_6-烷基)胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$與C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或 C_1-C_4-烷基取代。

G^5 特佳為代表於各情形下為直鏈或分支鏈之乙基、丙基、丁基、戊基、己基、庚基或辛基，各者可於任何位置連接及視需要被得自下述組群之相同或不同取代基單-至四取代：氟、氯、溴、碘、C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_4-烷基亞磺醯基、C_1-C_4-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷氧基、C_1-C_4-烷胺基、二(C_1-C_4-烷基)胺基、各具有1至9個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_4-鹵基烷硫基、

C_1-C_4-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、C_1-C_4-鹵基烷氧基、C_1-C_4-鹵基烷胺基、鹵基-二(C_1-C_4-烷基)胺基、-$SiR^8R^9R^{10}$、環丙基、二氟環丙基、環丁基、環戊基與環己基。

式(IX)之炔烴類為供合成用之已知化學藥劑。

式(X)提供作為施行根據本發明製法(g)起始物質用之進一步，替代地，所需烯烴類之概括性界定。

G^6、G^7與G^8彼此獨立地較佳為各代表氫或烷基，其視需要被得自下述組群之相同或不同取代基單-至四取代：氟、氯、溴、碘、C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷氧基、C_1-C_6-烷胺基、二(C_1-C_6-烷基)胺基、C_1-C_6-鹵基烷硫基、C_1-C_6-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_6-鹵烷基磺醯基、C_1-C_6-鹵基烷氧基、C_1-C_6-鹵基烷胺基、鹵基-二(C_1-C_6-烷基)胺基、-$SiR^8R^9R^{10}$與C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或C_1-C_4-烷基取代及開鏈分子部分之碳原子總數不超過12個。

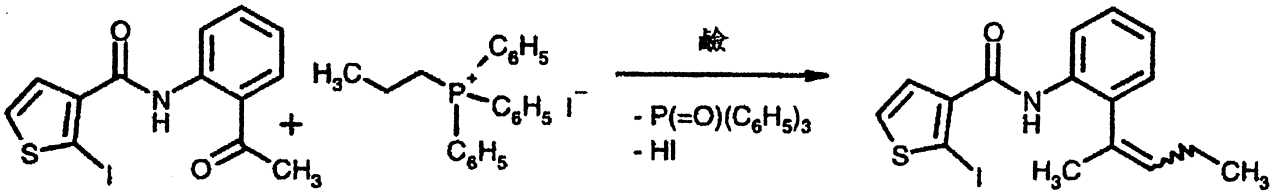
G^6、G^7與G^8彼此獨立地特佳為各代表於各情形下為直鏈或分支鏈之乙基、丙基、丁基、戊基、己基、庚基或辛基，各者可於任何位置連接及視需要被得自下述組群之相同或不同取代基單-至四取代：氟、氯、溴、碘、C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_4-烷基亞磺醯基、C_1-C_4-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷氧基、C_1-C_4-烷胺基、二(C_1-C_4-烷基)胺基、各具有1至9個氟、氯及/或溴原子之

C_1-C_4-鹵基烷硫基、C_1-C_4-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、C_1-C_4-鹵基烷氧基、C_1-C_4-鹵基烷胺基、鹵基-二(C_1-C_4-烷基)胺基、-$SiR^8R^9R^{10}$、環丙基、二氟環丙基、環丁基、環戊基與環己基，其中開鏈分子部分之碳原子總數不超過 12 個。。

式(X)之烯烴類為供合成用之已知化學藥劑。

製法(h)

以 N-(2-乙醯基苯基)-2-噻吩-3-羧醯胺與碘化三苯基(丙基)鏻為起始物質，根據製法(h)之途徑可由下文反應圖式說明。



式(XI)提供作為施行根據本發明製法(h)起始物質用之所需酮類之概括性界定。於此式中，A、Hal、R 與 M 較佳、特佳及更特佳為具有根據本發明式(I)化合物之相關說明中分別為彼等基團之較佳、特佳及更特佳者所述及之彼等意義。

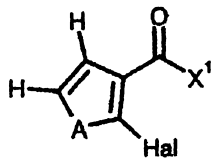
G^9 較佳為代表 C_2-C_{10}-烷基，其視需要被得自下述組群之相同或不同取代基單-至四取代：氟、氯、溴、碘、C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷氧基、C_1-C_6-烷胺基、二(C_1-C_6-烷基)胺基、C_1-C_6-鹵基烷硫基、C_1-C_6-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_6-鹵烷基磺醯基、C_1-C_6-鹵基烷氧基、C_1-C_6-鹵

基烷胺基、鹵基-二(C_1-C_6-烷基)胺基、-$SiR^8R^9R^{10}$與C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或C_1-C_4-烷基取代。

G^9 特佳為代表於各情形下為直鏈或分支鏈之乙基、丙基、丁基、戊基、己基、庚基或辛基，各者可於任何位置連接及視需要被得自下述組群之相同或不同取代基單-至四取代：氟、氯、溴、碘、C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_4-烷基亞磺醯基、C_1-C_4-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷氧基、C_1-C_4-烷胺基、二(C_1-C_4-烷基)胺基、各具有1至9個氟、氯及/或溴原子之C_1-C_4-鹵基烷硫基、C_1-C_4-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、C_1-C_4-鹵基烷氧基、C_1-C_4-鹵基烷胺基、鹵基-二(C_1-C_4-烷基)胺基、-$SiR^8R^9R^{10}$、環丙基、二氟環丙基、環丁基、環戊基與環己基。

式(XI)之酮類迄今尚未被揭示。彼等為新穎化合物，亦形成本申請案之部分主題，其製法為

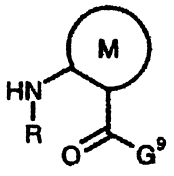
m) 使式(II)之羧酸衍生物



(II)

式中A、Hal與X^1如上文之界定，

適當時於觸媒存在下、適當時於縮合劑存在下、適當時於酸結合劑存在下及適當時於稀釋劑存在下，與式(XVII)之酮基苯胺類反應



(XVII)

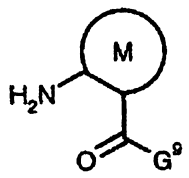
式中 R、M 與 G^9 如上文之界定。

作為施行根據本發明製法(m)起始物質用所需之式(II)羧酸衍生物已於根據本發明製法(a)中有相關之敘述。

式(XVII)提供作為施行根據本發明製法(m)起始物質用之進一步所需酮基苯胺類之概括性界定。於此式(XVII)中，R、M 與 G^9 較佳、特佳及更特佳為具有根據本發明式(I)與(XI)諸化合物之相關說明中分別為彼等基團之較佳、特佳及更特佳者所述及之彼等意義。

式(XVII)之酮基苯胺類為供合成用之一般習知化學藥劑(參見，例如，J. Am. Chem. Soc. 1978, 100, 4842-4857 或 US 4,032,573)。

亦可先行製備式(XVII-a)之羥烷基苯胺衍生物



(XVII-a)

式中 M 與 G^9 如上文之界定，接著，適當時，於鹼存在下及於稀釋劑存在下，使彼等化合物與式(XIII)之鹵化物反應[同樣應用根據本發明製法(i)之反應條件]。

$$R^a—X^6 \qquad (XIII)$$

式中 R^a 與 X^6 如上文之界定。

式(XII)提供作為施行根據本發明製法(h)起始物質用

之進一步所需磷化合物之概括性界定。

G^{10} 較佳為代表 C_2-C_{10}-烷基，其視需要被得自下述組群之相同或不同取代基單-至四取代：氟、氯、溴、碘、C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷氧基、C_1-C_6-烷胺基、二(C_1-C_6-烷基)胺基、C_1-C_6-鹵基烷硫基、C_1-C_6-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_6-鹵烷基磺醯基、C_1-C_6-鹵基烷氧基、C_1-C_6-鹵基烷胺基、鹵基-二(C_1-C_6-烷基)胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$ 與 C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或 C_1-C_4-烷基取代。

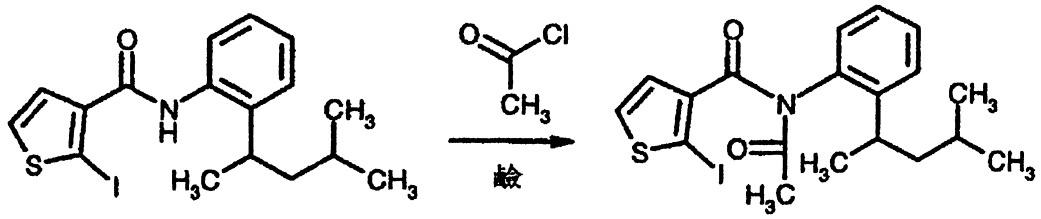
G^{10} 特佳為代表於各情形下為直鏈或分支鏈之乙基、丙基、丁基、戊基、己基、庚基或辛基，各者可於任何位置連接及視需要被得自下述組群之相同或不同取代基單-至四取代：氟、氯、溴、碘、C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_4-烷基亞磺醯基、C_1-C_4-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷氧基、C_1-C_4-烷胺基、二(C_1-C_4-烷基)胺基、各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_4-鹵基烷硫基、C_1-C_4-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、C_1-C_4-鹵基烷氧基、C_1-C_4-鹵基烷胺基、鹵基-二(C_1-C_4-烷基)胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$、環丙基、二氟環丙基、環丁基、環戊基與環己基。

Px 較佳為代表 $-P^+(C_6H_5)_3Cl^-$、$-P^+(C_6H_5)_3Br^-$、$-P^+(C_6H_5)_3I^-$、$-P(=O)(OCH_3)_3$ 或 $-P(=O)(OC_2H_5)_3$ 等基團。

式(XII)之磷化合物係已知及/或可利用已知方法予以製備(參見，例如，Justus Liebigs Ann. Chem. 1953, 580, 44-57 或 Pure Appl. Chem. 1964, 9, 307-335)。

製法(i)

以 N-[2-(1,3-二甲基丁基)苯基]-2-碘噻吩-3-羧醯胺與乙醯氯為起始物質，根據製法(i)之途徑可由下文反應圖式說明。



式(I-b)提供作為施行根據本發明製法(i)起始物質用之所需 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類之概括性界定。於此式(I-b)中，A、Hal、M 與 Z 較佳、特佳及更特佳為具有根據本發明式(I)化合物之相關說明中分別為彼等基團之較佳、特佳及更特佳者所述及之彼等意義。

式(I-b)化合物係根據本發明之化合物，可利用製法(a)至(h)予以製備。

式(XIII)提供作為施行根據本發明製法(i)起始物質用之進一步所需鹵化物之概括性界定。於此式(XIII)中，R^a 較佳、特佳及更特佳為具有式(I-c)化合物之相關說明中分別為彼等基團之較佳、特佳及更特佳者所述及之彼等意義。X^6 代表氯、溴或碘。

式(XIII)之鹵化物為已知之化合物。

反應條件

施行根據本發明製法(a)、(j)、(k)、(l)與(m)之適當稀釋劑為所有惰性無機溶劑。彼等較佳包括脂族、脂環或芳族烴，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氫萘；鹵化烴，例如，氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷；醚類，例如乙醚、異丙醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧乙烷、1,2-二乙氧乙烷或甲苯醚；酮類，例如丙酮、丁酮、甲基異丁基酮或環己酮；腈類，例如乙腈、丙腈、正-或異丁腈或苯甲腈；醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯替苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲替磷醯三胺；彼等與水或純水之混合物。

根據本發明之製法(a)、(j)、(k)、(l)與(m)，適當時，則於適當酸接受劑存在下進行。適當之酸接受劑為所有習知無機或有機鹼，較佳包括鹼土金屬或鹼金屬氫化物、氫氧化物、胺化物、醇鹽、乙酸鹽、碳酸鹽或碳酸氫鹽，例如，氫化鈉、胺化鈉、二異丙基胺化鋰、甲醇鈉、乙醇鈉、第三丁醇鉀、氫氧化鈉、氫氧化鉀、乙酸鈉、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鉀、碳酸氫鈉或碳酸銨，以及三級胺例如三甲基胺、三乙基胺、三丁基胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基苄基胺、吡啶、N-甲基六氫吡啶、N-甲基嗎啉、N,N-二甲基胺基吡啶、二氮雜雙環辛烷(DABCO)、二氮雜雙環壬烯(DBN)或二氮雜雙環十一烯(DBU)。

根據本發明之製法(a)、(j)、(k)、(l)與(m)，適當時，則於適當縮合劑存在下進行。適當之縮合劑為習知用於此等醯胺化反應之所有縮合劑。可述及之實例為醯基鹵形成劑，例如光氣、三溴化磷、三氯化磷、五氯化磷、氯氧化磷或亞硫醯氯；酐形成劑，例如氯甲酸乙酯、氯甲酸甲酯、氯甲酸異丙酯、氯甲酸異丁酯或甲烷磺醯氯；碳化二亞胺類，例如 N,N'-二環己基碳化二亞胺(DCC)，或其他習知縮合劑例如五氧化磷、多磷酸、N,N'-羰基二咪唑、2-乙氧基-N-乙氧羰基-1,2-二氫喹啉(EEDQ)、三苯膦/四氯化碳或六氟磷酸溴三吡咯烷鏻。

根據本發明之製法(a)、(j)、(k)、(l)與(m)，適當時，則於適當觸媒存在下進行。可述及之實例為 4-二甲胺基吡啶、1-羥基-苯並三唑或二甲基甲醯胺。

於施行根據本發明之製法(a)、(j)、(k)、(l)與(m)時，反應溫度可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，該等製法係於 0℃ 至 150℃ 之溫度下，較佳為於 0℃ 至 80℃ 之溫度下進行。

施行根據本發明之製法(a)製備式(I)化合物時，每莫耳式(II)羧酸衍生物通常使用 0.8 至 15 莫耳，較佳為 0.8 至 8 莫耳式(III)之苯胺衍生物。

施行根據本發明之製法(j)製備式(IV)化合物時，每莫耳式(II)羧酸衍生物通常使用 0.8 至 15 莫耳，較佳為 0.8 至 8 莫耳式(XIV)之鹵基苯胺。

施行根據本發明之製法(k)製備式(VI)化合物時，每莫

耳式(II)羧酸衍生物通常使用 0.8 至 15 莫耳，較佳為 0.8 至 8 莫耳式(XV)之苯胺酮酸衍生物。

施行根據本發明之製法(l)製備式(VIII)化合物時，每莫耳式(II)羧酸衍生物通常使用 0.8 至 15 莫耳，較佳為 0.8 至 8 莫耳式(XVI)之羥烷基苯胺衍生物。

施行根據本發明之製法(m)製備式(IX)化合物時，每莫耳式(II)羧酸衍生物通常使用 0.8 至 15 莫耳，較佳為 0.8 至 8 莫耳式(XVII)之酮基苯胺。

施行根據本發明製法(b)、(c)與(d)之適當稀釋劑為所有惰性有機溶劑。彼等較佳包括脂族、脂環或芳族烴，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氫萘；醚類，例如乙醚、異丙醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧乙烷、1,2-二乙氧乙烷或甲苯醚；腈類，例如乙腈、丙腈、正-或異丁腈或苯甲腈；醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯替苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲替磷醯三胺；酯類，例如乙酸甲酯或乙酸乙酯；亞碸類，例如二甲亞碸；碸類，例如環丁碸；醇類，例如甲醇、乙醇、正-或異丙醇、正-、異-、第二-或第三丁醇、乙二醇、丙-1,2-二醇、乙氧乙醇、甲氧乙醇、二乙二醇單甲醚、二乙二醇單乙醚；彼等與水或純水之混合物。

於施行根據本發明之製法(b)、(c)與(d)時，反應溫度可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，該等製法係於 0℃至 180℃之溫度下，較佳為於 20℃至 150℃之溫度下進

行。

根據本發明之製法(b)、(c)與(d)，適當時，則於適當酸接受劑存在下進行。適當之酸接受劑為所有習知無機或有機鹼，較佳包括鹼土金屬或鹼金屬氫化物、氫氧化物、胺化物、醇鹽、乙酸鹽、氟化物、磷酸鹽、碳酸鹽或碳酸氫鹽，例如，氫化鈉、胺化鈉、二異丙基胺化鋰、甲醇鈉、乙醇鈉、第三丁醇鉀、氫氧化鈉、氫氧化鉀、乙酸鈉、磷酸鈉、磷酸鉀、氟化鉀、氟化銫、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鉀、碳酸氫鈉或碳酸銫，以及三級胺例如三甲基胺、三乙基胺、三丁基胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基苄基胺、吡啶、N-甲基六氫吡啶、N-甲基嗎啉、N,N-二甲基胺基吡啶、二氮雜雙環辛烷(DABCO)、二氮雜雙環壬烯(DBN)或二氮雜雙環十一烯(DBU)。

根據本發明之製法(b)、(c)與(d)係於觸媒，例如，鈀鹽或複合物，存在下進行。彼等觸媒較佳為氯化鈀、乙酸鈀、肆(三苯膦)鈀、二氯化雙(三苯膦)鈀或氯化 1,1'-雙(二苯基膦基)雙(環戊二烯基)鐵鈀(II)。

亦可藉由分別添加鈀鹽及複合配位體，例如，三乙基磷烷、三-第三丁基磷烷、三環己基磷烷、2-(二環己基磷烷)聯二苯、2-(二-第三丁基磷烷)聯二苯、2-(二環己基磷烷)-2'-(N,N-二甲胺基)聯二苯、三苯基磷烷、參-(鄰甲苯基)- 磷烷、3-(二苯基膦基)苯磺酸鈉、參-2-(甲氧苯基)磷烷、2,2'-雙(二苯基磷烷)-1,1'-聯二萘、1,4-雙(二苯基磷烷)丁烷、1,2-雙(二苯基磷烷)乙烷、1.4-雙(二環己基磷烷)丁

烷、1,2-雙(二環己基磷烷)乙烷、2-(二環己基磷烷)-2'-(N,N-二甲胺基)聯二苯、雙(二苯基膦基)雙(環戊二烯基)鐵或參-(2,4-第三丁基苯基)亞磷酸酯至反應混合物中，以於反應混合物中產生鈀複合物。

施行根據本發明之製法(b)製備式(I)化合物時，每莫耳式(IV)鹵基羧醯胺通常添加 1 至 15 莫耳，較佳為 2 至 8 莫耳式(V)之硼酸衍生物。

施行根據本發明之製法(c)製備式(I)化合物時，每莫耳式(VI)硼酸衍生物通常使用 0.8 至 15 莫耳，較佳為 0.8 至 8 莫耳式(VII)之苯基衍生物。

施行根據本發明之製法(d)製備式(I)化合物時，每莫耳式(IV)鹵基羧醯胺通常使用 0.8 至 15 莫耳，較佳為 0.8 至 8 莫耳式(VII)之苯基衍生物及 0.8 至 15 莫耳，較佳為 0.8 至 8 莫耳 4,4,4',4',5,5,5',5'-八甲基-2,2'-雙-1,3,2-二噁硼茂烷。

施行根據本發明製法(e)之適當稀釋劑為所有惰性有機溶劑。彼等較佳包括脂族或脂環烴，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷或十氫萘；醚類，例如乙醚、異丙醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧乙烷或 1,2-二乙氧乙烷；醇類，例如甲醇、乙醇、正-或異丙醇、正-、異-、第二-或第三丁醇、乙二醇、丙-1,2-二醇、乙氧乙醇、甲氧乙醇、二乙二醇單甲醚、二乙二醇單乙醚；彼等與水或純水之混合物。

根據本發明之製法(e)係於觸媒存在下進行。適當觸媒

為習知用於氫化反應之所有觸媒。可述及之實例為：阮尼鎳(Raney-nickel)、適當時披於支撐體(例如，活性碳)上之鈀或鉑。

於施行根據本發明之製法(e)時，反應溫度可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，此製法係於0℃至150℃之溫度下，較佳為於20℃至100℃之溫度下進行。

施行根據本發明製法(f)之適當稀釋劑為所有惰性有機溶劑。彼等較佳包括脂族、脂環或芳族烴，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氫萘；鹵化烴，例如，氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷；醚類，例如乙醚、異丙醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧乙烷、1,2-二乙氧乙烷或甲苯醚；酮類，例如丙酮、丁酮、甲基異丁基酮或環己酮；腈類，例如乙腈、丙腈、正-或異丁腈或苯甲腈；醯胺類，例如N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯替苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲替磷醯三胺；酯類，例如乙酸甲酯或乙酸乙酯；亞碸類，例如二甲亞碸；碸類，例如環丁碸；醇類，例如甲醇、乙醇、正-或異丙醇、正-、異-、第二-或第三丁醇、乙二醇、丙-1,2-二醇、乙氧乙醇、甲氧乙醇、二乙二醇單甲醚、二乙二醇單乙醚；彼等與水或純水之混合物。

根據本發明之製法(f)，適當時，則於適當酸存在下進行。適當酸為所有無機及有機質子酸與路易氏酸，以及所

有聚合酸；包括例如氯化氫、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、二氟乙酸、甲磺酸、三氟甲磺酸、甲苯磺酸、三氟化硼(亦可呈醚合物)、三溴化硼、三氯化鋁、四氯化鈦、正鈦酸四丁酯、氯化鋅、氯化鐵(III)、五氯化銻、酸性離子交換劑、酸性氧化鋁及酸性矽膠。

於施行根據本發明之製法(f)時，反應溫度可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，此製法係於0℃至150℃之溫度下，較佳為於0℃至100℃之溫度下進行。

施行根據本發明製法(g)之適當稀釋劑為所有惰性有機溶劑。彼等較佳包括腈類，例如乙腈、丙腈、正-或異丁腈或苯甲腈；或醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯替苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲替磷醯三胺。

根據本發明之製法(g)，適當時，則於適當酸接受劑存在下進行。適當之酸接受劑為所有習知無機或有機鹼，較佳包括鹼土金屬或鹼金屬氫化物、氫氧化物、胺化物、醇鹽、乙酸鹽、碳酸鹽或碳酸氫鹽，例如，氫化鈉、胺化鈉、甲醇鈉、乙醇鈉、第三丁醇鉀、氫氧化鈉、氫氧化鉀、氫氧化銨、乙酸鈉、乙酸鉀、乙酸鈣、乙酸銨、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鉀、碳酸氫鈉或碳酸銨，以及三級胺例如三甲基胺、三乙基胺、三丁基胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基苄基胺、吡啶、N-甲基六氫吡啶、N-甲基嗎啉、N,N-二甲基胺基吡啶、二氮雜雙環辛烷(DABCO)、二氮雜雙環壬烯(DBN)或二氮雜雙環十一烯(DBU)。

根據本發明之製法(g)係於一或多種觸媒存在下進行。適用於此用途者為鈀鹽或鈀複合物，彼等較佳為氯化鈀、乙酸鈀、肆(三苯膦)鈀或二氯化雙(三苯膦)鈀。亦可藉由分別添加鈀鹽及複合配位體至反應混合物中，以於反應混合物中產生鈀複合物。適當的配位體較佳為有機磷化合物，可述及之實例為：三苯膦、三-鄰甲苯基膦、2,2'-雙(二苯基膦基)-1,1'-聯二萘、二環己基膦聯二苯、1,4-雙(二苯基膦基)丁烷、雙二苯基膦基雙(環戊二烯基)鐵、二-(第三丁基膦基)聯二苯、二(環己基膦基)聯二苯、2-二環己基膦基-2'-N,N-二甲胺基聯二苯、三環己基膦、三-第三丁基膦。然而，亦可省掉配位體。

根據本發明之製法(g)，適當時，則進一步於另外的金屬鹽[例如銅鹽如碘化銅(I)]存在下進行。

於施行根據本發明之製法(g)時，反應溫度可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，此製法係於20℃至180℃之溫度下，較佳為於50℃至150℃之溫度下進行。

施行根據本發明之製法(g)製備式(I)化合物時，每莫耳式(IV)鹵基羧醯胺通常使用1至5莫耳，較佳為1至2莫耳式(IX)之炔烴或式(X)之烯烴。

施行根據本發明製法(h)之適當稀釋劑為所有惰性有機溶劑。彼等較佳包括脂族、脂環或芳族烴，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氫萘；鹵化烴，例如，氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷；醚類，例如乙醚、

異丙醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧乙烷、1,2-二乙氧乙烷或甲苯醚；腈類，例如乙腈、丙腈、正-或異丁腈或苯甲腈；醯胺類，例如N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯替苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲替磷醯三胺；酯類，例如乙酸甲酯或乙酸乙酯；亞碸類，例如二甲亞碸；碸類，例如環丁碸；醇類，例如甲醇、乙醇、正-或異丙醇、正-、異-、第二-或第三丁醇、乙二醇、丙-1,2-二醇、乙氧乙醇、甲氧乙醇、二乙二醇單甲醚、二乙二醇單乙醚。

根據本發明之製法(h)，適當時，則於適當酸接受劑存在下進行。適當酸接受劑為所有習知之強鹼，較佳包括鹼土金屬或鹼金屬氫化物、氫氧化物、胺化物、醇鹽或鹼金屬烴化合物，例如，氫化鈉、氫氧化鈉、氫氧化鉀、胺化鈉、二異丙基胺化鋰、甲醇鈉、乙醇鈉、第三丁醇鉀、甲基鋰、苯基鋰或丁基鋰。

於施行根據本發明之製法(h)時，反應溫度可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，此製法係於-80℃至150℃之溫度下，較佳為於-30℃至80℃之溫度下進行。

施行根據本發明之製法(h)製備式(I)化合物時，每莫耳式(XI)酮通常使用1至5莫耳，較佳為1至2莫耳式(XII)之磷化合物。

施行根據本發明製法(i)之適當稀釋劑為所有惰性有機溶劑。彼等較佳包括脂族、脂環或芳族烴，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲

苯或十氫萘；鹵化烴，例如，氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷；醚類，例如乙醚、異丙醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧乙烷、1,2-二乙氧乙烷或甲苯醚；或醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯替苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲替磷醯三胺。

根據本發明之製法(i)係於鹼存在下進行。適當鹼為所有習知無機或有機鹼，較佳包括鹼土金屬或鹼金屬氫化物、氫氧化物、胺化物、醇鹽、乙酸鹽、碳酸鹽或碳酸氫鹽，例如，氫化鈉、胺化鈉、甲醇鈉、乙醇鈉、第三丁醇鉀、氫氧化鈉、氫氧化鉀、氫氧化銨、乙酸鈉、乙酸鉀、乙酸鈣、乙酸銨、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鉀、碳酸氫鈉或碳酸銫，以及三級胺例如三甲基胺、三乙基胺、三丁基胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基苄基胺、吡啶、N-甲基六氫吡啶、N-甲基嗎啉、N,N-二甲基胺基吡啶、二氮雜雙環辛烷(DABCO)、二氮雜雙環壬烯(DBN)或二氮雜雙環十一烯(DBU)。

於施行根據本發明之製法(i)時，反應溫度可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，此製法係於 0℃ 至 150℃ 之溫度下，較佳為於 20℃ 至 110℃ 之溫度下進行。

施行根據本發明之製法(i)製備式(I)化合物時，每莫耳式(I-b)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺通常使用 0.2 至 5 莫耳，較佳為 0.5 至 2 莫耳式(XIII)之鹵化物。

反應圖式 1 製程(1)至(4)之反應條件：

施行反應圖式 1 製程(1)之適當稀釋劑為所有惰性有機溶劑。彼等較佳包括脂族、脂環或芳族烴，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氫萘；鹵化烴，例如，氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷；醚類，例如乙醚、異丙醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧乙烷、1,2-二乙氧乙烷或甲苯醚；醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯替苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲替磷醯三胺；或醇類，例如甲醇、乙醇、異丙醇。

反應圖式 1 製程(1)係於適當還原劑存在下進行。適當還原劑為所有習知無機或有機還原劑，較佳包括鹼土金屬或鹼金屬氫化物例如氫化鈉、或複合氫化物例如氫化鋁鋰、硼氫化鈉、氰基硼氫化鈉、氫化二異丁基鋁、硼烷、二硼烷或硼烷複合物例如硼烷-吡啶、矽烷類例如三乙基矽烷、金屬例如鈉、鋰、鋅、鐵、或氫。

反應圖式 1 之製程(1)，適當時，則於適當酸或路易氏酸存在下進行。適當酸/路易氏酸為習知可用於由此等酸/路易氏酸傳介的還原反應之所有酸/路易氏酸。可述及之實例為鹽酸、乙酸、三氟乙酸、三氟化硼或三氟化硼複合物例如三氟化硼醚合物、三氯化鋁、三氯化鈰、無機或有機鈦化合物例如四氯化鈦、四異丙醇鈦。

反應圖式 1 之製程(1)，適當時，則於觸媒存在下進行。

可述及之實例為金屬或金屬鹽，特別是過渡金屬或其鹽，例如，鉑、鈀、鎳(阮尼鎳)、銥、銠、鋨、鐵、釕、鈷。適當時，則彼等金屬或金屬鹽亦可結合或施敷於樹脂或表面或支撐體(例如碳)。

於施行反應圖式1之製程(1)時，反應溫度可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，此製程係於0℃至200℃之溫度下，較佳為於0℃至150℃之溫度下進行。

當反應圖式1製程(1)中所用還原劑為氫時，壓力可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，此製程係於1巴至300巴壓力下，較佳為1巴至100巴壓力下進行。

施行反應圖式1之製程(1)時，每莫耳起始物質通常使用0.2至10莫耳，較佳為0.5至5莫耳還原劑。

施行反應圖式1製程(2)之適當稀釋劑為所有惰性有機溶劑。彼等較佳包括脂族、脂環或芳族烴，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氫萘；鹵化烴，例如，氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷；醚類，例如乙醚、異丙醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧乙烷、1,2-二乙氧乙烷或甲苯醚；或醯胺類，例如N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯替苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲替磷醯三胺。

反應圖式1之製程(2)，適當時，則於適當酸接受劑存在下進行。適當之酸接受劑為所有習知無機或有機鹼，較佳包括鹼土金屬或鹼金屬氫化物、氫氧化物、胺化物、醇

鹽、乙酸鹽、碳酸鹽或碳酸氫鹽，例如，氫化鈉、胺化鈉、甲醇鈉、乙醇鈉、第三丁醇鉀、氫氧化鈉、氫氧化鉀、氫氧化銨、乙酸鈉、乙酸鉀、乙酸鈣、乙酸銨、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鉀、碳酸氫鈉或碳酸銨，以及三級胺例如三甲基胺、三乙基胺、三丁基胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基苄基胺、吡啶、N-甲基六氫吡啶、N-甲基嗎啉、N,N-二甲基胺基吡啶、二氮雜雙環辛烷(DABCO)、二氮雜雙環壬烯(DBN)或二氮雜雙環十一烯(DBU)。

反應圖式 1 之製程(2)，適當時，則於適當鹵化劑存在下進行。適當鹵化劑為習知用於此等鹵化反應之所有鹵化劑。可述及之實例為鹵化物形成劑，例如光氣、三溴化磷、三氯化磷、五氯化磷、氯氧化磷、草醯氯或亞硫醯氯；酐形成劑，例如氯甲酸乙酯、氯甲酸甲酯、氯甲酸異丙酯、氯甲酸異丁酯或甲烷磺醯氯；或其他習知縮合劑例如五氧化磷、多磷酸、N,N'-羰基二咪唑、2-乙氧基-N-乙氧羰基-1,2-二氫喹啉(EEDQ)、三苯膦/四氯化碳或六氟磷酸溴三吡咯烷鏻。

反應圖式 1 之製程(2)，適當時，則於觸媒存在下進行。可述及之實例為 4-二甲胺基吡啶、1-羥基苯並三唑或二甲基甲醯胺。

於施行反應圖式 1 之製程(2)時，反應溫度可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，此製程係於 0℃ 至 200℃ 之溫度下，較佳為於 0℃ 至 150℃ 之溫度下進行。

施行反應圖式 1 之製程(2)時，每莫耳起始物質通常使

用 0.2 至 10 莫耳，較佳為 0.5 至 5 莫耳鹵化劑。

施行反應圖式 1 製程(3)之適當稀釋劑為所有惰性有機溶劑。彼等較佳包括脂族、脂環或芳族烴，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氫萘；鹵化烴，例如，氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷；醚類，例如乙醚、異丙醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧乙烷、1,2-二乙氧乙烷或甲苯醚；或醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯替苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲替磷醯三胺。

反應圖式 1 之製程(3)係於鹼存在下進行。適當之鹼為所有習知無機或有機鹼，較佳包括鹼土金屬或鹼金屬氫化物、氫氧化物、胺化物、醇鹽、乙酸鹽、碳酸鹽或碳酸氫鹽，例如，氫化鈉、胺化鈉、甲醇鈉、乙醇鈉、第三丁醇鉀、氫氧化鈉、氫氧化鉀、氫氧化銨、乙酸鈉、乙酸鉀、乙酸鈣、乙酸銨、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鉀、碳酸氫鈉或碳酸銫，以及三級胺例如三甲基胺、三乙基胺、三丁基胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基苄基胺、吡啶、N-甲基六氫吡啶、N-甲基嗎啉、N,N-二甲基胺基吡啶、二氮雜雙環辛烷(DABCO)、二氮雜雙環壬烯(DBN)或二氮雜雙環十一烯(DBU)。

於施行反應圖式 1 之製程(3)時，反應溫度可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，此製程係於 0℃ 至 200℃ 之溫度下，較佳為於 20℃ 至 150℃ 之溫度下進行。

施行反應圖式1之製程(3)時，每莫耳起始物質通常使用0.2至5莫耳，較佳為0.5至2莫耳式H—$Z^{3\text{-}C}$之化合物。

施行反應圖式1製程(4)之適當稀釋劑為所有惰性有機溶劑。彼等較佳包括脂族、脂環或芳族烴，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氫萘；醚類，例如乙醚、異丙醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧乙烷、1,2-二乙氧乙烷或甲苯醚；醯胺類，例如N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯替苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲替磷醯三胺；亞碸類，例如二甲亞碸；碸類，例如環丁碸；醇類，例如甲醇、乙醇、正-或異丙醇、正-、異-、第二-或第三丁醇、乙二醇、丙-1,2-二醇、乙氧乙醇、甲氧乙醇、二乙二醇單甲醚、二乙二醇單乙醚、三乙二醇；彼等與水或純水之混合物。

反應圖式1之製程(4)係於金屬存在下進行。適當金屬較佳為過渡金屬，例如，鈀、鉑、銠、鎳(阮尼鎳)、鐵、鈷、釕、銥、鋅或銖。適當時，則彼等金屬可依附於支撐體例如碳、樹脂、沸石、鹼金屬或鹼土金屬硫酸鹽。

反應圖式1之製程(4)係於還原劑存在下進行。適當還原劑較佳為元素氫、甲酸鹽較佳為鹼金屬甲酸鹽例如甲酸鈉、惟亦可為甲酸銨，或者金屬氫化物或複合金屬氫化物例如氫化鋁鋰、硼氫化鈉。

反應圖式1之製程(4)可於酸存在下進行。適當酸較佳為有機酸例如甲酸、乙酸、抗壞血酸，惟亦可為無機酸例

如鹽酸或硫酸。

反應圖式 1 之製程(4)可於鹼存在下進行。適當鹼較佳為有機鹼例如吡啶，惟亦可為鹼金屬或鹼土金屬氫氧化物例如氫氧化鈉或氫氧化鋇之水溶液。

於施行反應圖式 1 之製程(4)時，反應溫度可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，此製程係於-80℃至 300℃之溫度下，較佳為於 0℃至 200℃之溫度下進行。

若係使用元素氫，則反應圖式 1 製程(4)係於介於 0.5 巴與 200 巴間，較佳為介於 1 與 100 巴間之氫氣壓下進行。

施行反應圖式 1 之製程(4)時，每莫耳起始物質通常使用 0.8 至 1000 莫耳，較佳為 1 至 500 莫耳還原劑(甲酸銨，氫化物等)。

反應圖式 2 製程(5)至(11)之反應條件：

施行製程(5)之適當稀釋劑為所有惰性有機溶劑。彼等較佳包括脂族、脂環或芳族烴，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氫萘；醚類，例如乙醚、異丙醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧乙烷、1,2-二乙氧乙烷或甲苯醚。

製程(5)係於有機金屬化合物存在下進行。適當有機金屬化合物較佳為有機鋰化合物，例如正-、第二-、或第三丁基鋰、苯基鋰或甲基鋰。

於施行製程(5)時，反應溫度可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，此製法係於 120℃至 100℃之溫度下，較佳

為於 80℃ 至 20℃ 之溫度下進行。

施行製程(5)時，每莫耳起始物質通常使用 0.2 至 5 莫耳，較佳為 0.5 至 2 莫耳式 $Z^{3-E}—CO_2R^{17}$ 之酯。

施行製程(6)之適當稀釋劑為所有惰性有機溶劑。彼等較佳包括脂族、脂環或芳族烴，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氫萘；鹵化烴，例如，氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷；醚類，例如乙醚、異丙醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧乙烷、1,2-二乙氧乙烷或甲苯醚；酮類，例如丙酮、丁酮、甲基異丁基酮或環己酮；腈類，例如乙腈、丙腈、正-或異丁腈或苯甲腈；醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯替苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲替磷醯三胺；亞碸類，例如二甲亞碸；碸類，例如環丁碸；醇類，例如甲醇、乙醇、正-或異丙醇、正-、異-、第二-或第三丁醇、乙二醇、丙-1,2-二醇、乙氧乙醇、甲氧乙醇、二乙二醇單甲醚、二乙二醇單乙醚、三乙二醇；彼等與水或純水之混合物。

製程(6)係於酸存在下進行。適當酸較佳為無機酸，例如鹽酸、氫碘酸或氫溴酸、硫酸，或者有機酸，例如三氟乙酸、三氟甲磺酸。

於施行製程(6)時，反應溫度可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，此製程係於 0℃ 至 300℃ 之溫度下，較佳為於 20℃ 至 200℃ 之溫度下進行。

施行製程(6)時，每莫耳起始物質通常使用 0.1 至 10000 莫耳，較佳為 1 至 2000 莫耳酸。

施行製程(7)之適當稀釋劑為所有惰性有機溶劑。彼等較佳包括脂族、脂環或芳族烴，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氫萘；鹵化烴，例如，氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷；醚類，例如乙醚、異丙醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧乙烷、1,2-二乙氧乙烷或甲苯醚；酮類，例如丙酮、丁酮、甲基異丁基酮或環己酮；腈類，例如乙腈、丙腈、正-或異丁腈或苯甲腈；醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯替苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲替磷醯三胺；亞碸類，例如二甲亞碸；碸類，例如環丁碸；醇類，例如甲醇、乙醇、正-或異丙醇、正-、異-、第二-或第三丁醇、乙二醇、丙-1,2-二醇、乙氧乙醇、甲氧乙醇、二乙二醇單甲醚、二乙二醇單乙醚、三乙二醇；彼等與水或純水之混合物。

製程(7)係於鹼存在下進行。適當鹼較佳為鹼土金屬或鹼金屬氫氧化物，例如，氫氧化鈉、氫氧化鉀、氫氧化銨。

施行製程(7)時，反應溫度可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，此製程係於 100℃ 至 300℃ 之溫度下，較佳為於 150℃ 至 250℃ 之溫度下進行。

施行製程(7)時，每莫耳起始物質通常使用 0.2 至 5 莫耳，較佳為 0.5 至 3 莫耳肼或肼水合物。

施行製程(8)之適當稀釋劑為所有惰性有機溶劑。彼等較佳包括脂族、脂環或芳族烴，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氫萘；醚類，例如乙醚、異丙醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧乙烷、1,2-二乙氧乙烷或甲苯醚。

製程(8)係於有機金屬化合物存在下進行。適當有機金屬化合物較佳為甲基鎂氯化物、溴化物或碘化物或甲基鋰。

施行製程(8)時，反應溫度可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，此製程係於 120℃ 至 200℃ 之溫度下，較佳為於 80℃ 至 100℃ 之溫度下進行。

施行製程(8)時，每莫耳起始物質通常使用 0.8 至 10 莫耳，較佳為 1 至 5 莫耳有機金屬化合物。

施行製程(9)之適當稀釋劑為所有惰性有機溶劑。彼等較佳包括脂族、脂環或芳族烴，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氫萘；鹵化烴，例如，氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷；醚類，例如乙醚、異丙醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧乙烷、1,2-二乙氧乙烷或甲苯醚；酮類，例如丙酮、丁酮、甲基異丁基酮或環己酮；腈類，例如乙腈、丙腈、正-或異丁腈或苯甲腈；醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯替苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲替磷醯三胺；酯類，例如乙酸甲酯或乙酸乙酯；亞

碸類，例如二甲亞碸；碸類，例如環丁碸；醇類，例如甲醇、乙醇、正-或異丙醇、正-、異-、第二-或第三丁醇、乙二醇、丙-1,2-二醇、乙氧乙醇、甲氧乙醇、二乙二醇單甲醚、二乙二醇單乙醚；彼等與水或純水之混合物。

製程(9)，適當時，則於酸存在下進行。適當酸為所有無機及有機質子酸與路易氏酸，以及所有聚合酸，包括例如氯化氫、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、三氟乙酸、甲磺酸、三氟甲磺酸、甲苯磺酸、三氟化硼(亦可呈醚合物)、三溴化硼、三氯化鋁、四氯化鈦、正鈦酸四丁酯、氯化鋅、氯化鐵(III)、五氯化銻、酸性離子交換劑、酸性氧化鋁及酸性矽膠。

施行製程(9)時，反應溫度可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，此製程係於 0℃ 至 150℃ 之溫度下，較佳為於 0℃ 至 80℃ 之溫度下進行。

製程(9)與(10)亦可以串聯反應(「一壺反應」)進行。

施行製程(10)之適當稀釋劑為所有惰性有機溶劑。彼等較佳包括脂族或脂環烴，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷或十氫萘；醚類，例如乙醚、異丙醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧乙烷或 1,2-二乙氧乙烷；醇類，例如甲醇、乙醇、正-或異丙醇、正-、異-、第二-或第三丁醇、乙二醇、丙-1,2-二醇、乙氧乙醇、甲氧乙醇、二乙二醇單甲醚、二乙二醇單乙醚；彼等與水或純水之混合物。

製程(10)係於觸媒存在下進行。適當觸媒為習知用於

氫化反應之所有觸媒。可述及之實例為：阮尼鎳、鈀或鉑，適當時，則披於支撐體(例如，活性碳)上。

除了於氫結合觸媒存在下以外，製程(10)之氫化反應亦可於三乙基矽烷存在下進行。

施行製程(10)時，反應溫度可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，此製程係於 0℃ 至 150℃ 之溫度下，較佳為於 20℃ 至 100℃ 之溫度下進行。

製程(10)係於介於 0.5 巴與 200 巴間，較佳為介於 2 與 50 巴間，特佳為介於 3 與 10 巴間之氫氣壓下進行。

施行製程(11)之適當稀釋劑為所有惰性有機溶劑。彼等較佳包括脂族、脂環或芳族烴，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氫萘；醚類，例如乙醚、異丙醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧乙烷、1,2-二乙氧乙烷或甲苯醚；醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯替苯胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲替磷醯三胺；亞碸類，例如二甲亞碸；碸類，例如環丁碸；醇類，例如甲醇、乙醇、正-或異丙醇、正-、異-、第二-或第三丁醇、乙二醇、丙-1,2-二醇、乙氧乙醇、甲氧乙醇、二乙二醇單甲醚、二乙二醇單乙醚、三乙二醇；彼等與水或純水之混合物。

製程(11)係於金屬存在下進行。適當金屬較佳為過渡金屬，例如，鈀、鉑、銠、鎳、鐵、鈷、釕、銥或鋨。適當時，則彼等金屬可依附於支撐體例如碳、樹脂、沸石、

鹼金屬或鹼土金屬硫酸鹽。

製程(11)係於還原劑存在下進行。適當還原劑較佳為元素氫、甲酸鹽較佳為鹼金屬甲酸鹽例如甲酸鈉、惟亦可為甲酸銨，或者金屬氫化物(加氫脫鹵作用)。

製程(11)可於酸存在下進行。適當酸較佳為有機酸例如甲酸、乙酸、抗壞血酸，惟亦可為無機酸例如鹽酸或硫酸。

製程(11)可於鹼存在下進行。適當鹼較佳為有機鹼例如吡啶，惟亦可為鹼金屬或鹼土金屬氫氧化物例如氫氧化鈉或氫氧化鋇之水溶液。

施行製程(11)時，反應溫度可於相當廣範圍內有所不同。一般而言，此製程係於-80℃至300℃之溫度下，較佳為於0℃至200℃之溫度下進行。

若係使用元素氫，則根據本發明之製程(11)係於介於0.5巴與200巴間，較佳為介於1與100巴間之氫氣壓下進行。

施行根據本發明之製程(11)時，每莫耳起始物質通常使用0.8至1000莫耳，較佳為1至500莫耳還原劑(甲酸銨，氫化物等)。

根據本發明之所有製程通常係於常壓下進行，然而，亦可能於升壓或減壓下–通常介於0.1與10巴之間–操作。

根據本發明之物質具有強效之殺微生物性質，可於作物保護及原料保護上作為防治有害微生物(例如真菌與細菌)之用。

殺真菌劑可於作物保護上用於防治根腫菌綱、卵菌綱、壺菌綱、接合菌綱、子囊菌綱、擔子菌綱與半知菌綱等真菌。

殺細菌劑可於作物保護上用於防治假單胞菌科、根瘤菌科、腸桿菌科、棒桿菌科與鏈黴菌科等細菌。

於上文列舉學名下的引發真菌與細菌性病害之一些病原菌，可述及之實例如下(惟不擬構成侷限)：

黃單胞菌菌種，例如，野油菜黃單胞菌水稻變種(*Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*)；

假單胞菌菌種，例如，丁香假單胞菌黃瓜變種(*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*)；

歐文氏菌菌種，例如，解澱粉歐文氏菌(*Erwinia amylovora*)；

腐黴菌種，例如，終極腐黴(*Pythium ultimum*)；

疫黴菌種，例如，致病疫黴(*Phytophthora infestans*)；

假霜黴菌種，例如，葎草假霜黴(*Pseudoperonospora humuli*)或古巴假霜黴(*Pseudoperonospora cubensis*)；

單軸黴菌種，例如，葡萄生單軸黴(*Plasmopara viticola*)；

盤梗黴菌種，例如，蒲公英盤梗黴(*Bremia lactucae*)；

霜黴菌種，例如，豌豆霜黴(*Peronospora pisi*)或蕓苔霜黴(*Peronospora brassicae*)；

白粉菌菌種，例如，禾白粉菌(*Erysiphe graminis*)；

單絲殼菌種，例如，蒼耳單絲殼(*Sphaerotheca fuliginea*)；

叉絲單囊殼菌種，例如，白叉絲單囊殼(*Podosphaera*

leucotricha)；

黑星菌菌種，例如，蘋果黑星菌(*Venturia inaequalis*)；

核腔菌菌種，例如，圓核腔菌(*Pyrenophora teres*)或麥類核腔菌(*Pyrenophora graminea*)；[分生孢子型：Drechslera，同：長蠕孢屬(*Helminthosporium*)]；

旋孢腔菌菌種，例如，禾旋孢腔菌(*Cochliobolus sativus*)；[分生孢子型：Drechslera，同：長蠕孢屬]；

單胞銹菌菌種，例如，疣頂單胞銹菌(*Uromyces appendiculatus*)；

柄銹菌菌種，例如，隱匿柄銹菌(*Puccinia recondita*)；

核盤菌菌種，例如，蔬菜核盤菌(*Sclerotinia sclerotiorum*)；

腥黑粉菌菌種，例如，小麥網腥黑粉菌(*Tilletia caries*)；

黑粉菌菌種，例如，裸黑粉菌(*Ustilago nuda*)或燕麥散黑粉菌(*Ustilago avenae*)；

薄膜革菌菌種，例如，佐佐木薄膜革菌(*Pellicularia sasakii*)；

熱病菌菌種，例如，稻熱病菌(*Pyricularia oryzae*)；

鐮孢菌種，例如，大刀鐮孢(*Fusarium culmorum*)；

葡萄孢菌種，例如，灰葡萄孢(*Botrytis cinerea*)；

殼針孢菌種，例如，頴枯殼針孢(*Septoria nodorum*)；

小球腔菌菌種，例如，頴枯小球腔菌(*Leptosphaeria nodorum*)；

尾孢菌種，例如，變灰尾孢(*Cercospora canescens*)；

鏈格孢菌種，例如，蕓苔鏈格孢(*Alternaria brassicae*)；及

假小尾孢菌種，例如，小麥基腐病菌(*Pseudocercosporella herpotrichoides*)；

絲核菌菌種，例如，立枯絲核菌(*Rhizoctonia solani*)。

根據本發明之活性化合物於植物中亦具有強力鼓舞作用。因此，於植物被有害微生物侵襲時，適用於動員植物之內部防禦力。

於本說明書中，鼓舞植物(誘發抗性)之化合物欲被瞭解為意指能刺激植物防禦系統俾使經處理之植物隨後以有害微生物接菌時，對彼等微生物表現實質抗性之物質。

於本發明情形下，有害微生物欲被瞭解為意指植物病原性真菌、細菌及病毒。因此，根據本發明之化合物可於經所述病原菌侵襲處理後之特定期間內用於保護植物。達成此保護作用之特定期間自以活性化合物處理植物起，通常延續1至10天，較佳為1至7天。

於防治植物病害所需之活性化合物濃度下，植物的耐受性良好，因此活性化合物得以處理植物地上部分、增殖株與種子、及土壤。

根據本發明之活性化合物用於防治穀類植物病害，例如，對抗柄銹菌菌種，及葡萄與蔬果栽培之病害，例如，對抗葡萄孢、黑星菌或鏈格孢等菌種，具有特佳效果。

根據本發明之活性化合物亦適用於增加作物產量。此外，具有較少的毒性及植物對其之耐受性良好。

適當時，於特定濃度及施加率下，根據本發明之活性化合物亦可作為除草劑用，以調節植物生長及防治動物蟲

害。適當時，彼等亦可作為合成其他活性化合物之中間產物或前驅體用。

根據本發明，所有植物與部分植物體均可能處理。於本文中，植物欲被瞭解為意指所有植物與植物族群，例如需要及不需要之野生植物或收成植物(包括天然存在之收成植物)。收成植物為可利用習知植物育種及最適方法或利用生物技術與遺傳工程方法或這些方法之組合獲得之植物，包括基因轉殖植物及受或不受植物育種者之權利保護之植物栽培品種。部分植物體欲被瞭解為意指植物之所有地上與地下部分及器官，例如苗、葉、花與根，可述及之實例為葉、針、柄、莖、花、果實體、水果與種子以及根、塊莖與根莖。部分植物體亦包含經收獲之物料，及無性與有性繁殖物料，例如幼苗、塊莖、根莖、插條及種子。

根據本發明，以活性化合物處理植物及部分植物體係直接進行或根據習知處理法，例如利用浸漬、噴霧、蒸發、生霧、撒佈、漆上及於繁殖體之情形下，特別是於種子之情形下，進一步利用塗覆一或多層，作用於其環境、產地或貯存處。

於物料之保護上，根據本發明之化合物可用於保護工業物料對抗有害微生物之入侵及破壞。

於本說明書中，工業物料欲被瞭解為意指經製備供工業用途之無生命物料。舉例而言，擬由根據本發明化合物保護免受微生物改變或破壞之工業物料可為，膠黏劑、浸潤劑、紙與板、紡織品、皮革、木頭、油漆與塑料用品、

冷卻潤滑劑及可被微生物入侵或破壞之其他物料。生產工廠之零件，例如會被微生物增殖所傷害之冷卻水環路，亦可於欲被保護的物料範圍內被述及。可於本發明範圍內被述及之工業物料較佳為膠黏劑、浸潤劑、紙與板、皮革、木頭、油漆、冷卻潤滑劑及傳熱液體，特佳為木頭。

可述及之能降解或改變工業物料的微生物為，例如，細菌、真菌、酵母、藻類與黏菌。根據本發明之活性化合物較佳為作用於真菌(特別是黴菌)、使木頭褪色及破壞木頭之真菌(擔子菌綱)及黏菌與藻類。

可述及之實例為下述各屬之微生物：

鏈格孢屬，例如細極鏈格孢(*Alternaria tenuis*)、

曲黴屬，例如黑曲黴(*Aspergillus niger*)、

毛殼屬，例如球毛殼(*Chaetomium globosum*)、

粉孢革菌屬，例如粉孢革菌(*Coniophora puetana*)、

香菇屬，例如虎皮香菇(*Lentinus tigrinus*)、

青黴屬，例如灰綠青黴(*Penicillium glaucum*)、

多孔菌屬，例如變色多孔菌(*Polyporus versicolor*)、

短梗黴屬，例如出芽短梗黴(*Aureobasidium pullulans*)、

硬皮莖點黴屬，例如 *Sclerophoma pityophila*、

木黴屬，例如綠色木黴(*Trichoderma viride*)、

埃希氏菌屬，例如大腸桿菌(*Escherichia coli*)、

假單胞菌屬，例如綠膿桿菌(*Pseudomonas aeruginosa*)、及

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

視其特定物理及/或化學性質而定，活性化合物可轉化成習知調配劑例如溶液、乳液、懸浮液、粉劑、泡沫物、糊劑、粒劑、氣溶膠及於聚合物質中予以微膠囊化、供種子用之塗覆組成物、及ULV冷卻及加溫生霧調配劑。

彼等調配劑係以已知方法製造，例如將活性化合物與增充劑(亦即，液體溶劑、加壓下之液化氣體、及/或固體載劑)混合，視需要使用界面活性劑(亦即，乳化劑及/或分散劑)、及/或泡沫形成劑。若所用填充劑為水，則亦可，例如，使用有機溶劑作用輔助溶劑。本質上適當之液體溶劑為：芳族烴例如二甲苯、甲苯或烷基萘類；氯化芳族烴或氯化脂族烴例如氯苯類、氯乙烯類或二氯甲烷；脂族烴例如環己烷或鏈烷烴，例如石油餾分；醇類例如丁醇或乙二醇及其醚和酯；酮類例如丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁基酮或環己酮；強極性溶劑例如二甲基甲醯胺與二甲亞碸；或者水。液化氣體增充劑或載劑欲被瞭解為意指於標準溫度與大氣壓力下為氣體之液體，例如氣溶膠推進劑如鹵化烴，或者丁烷、丙烷、氮與二氧化碳。適當之固體載劑為：舉例而言，細磨之天然礦物例如高嶺土、黏土、滑石粉、白堊、石英、綠坡縷石、蒙脫土或矽藻土，及細磨之合成物料例如細微分割之矽石、氧化鋁與矽酸鹽。用於粒劑之適當固體載劑為：舉例而言，經壓碎與分級之天然岩石例如方解石、浮石、大理石、海泡石及白雲石，或者合成之無機與有機粗粉之合成粒劑，及有機物料例如鋸屑、椰殼、玉米穗及煙草稈之粒劑。適當之乳化劑及/或泡

沫形成劑為：舉例而言，非離子性及陰離子性乳化劑，例如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚，例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸酯、烷基硫酸酯、芳基磺酸酯、或蛋白質水解物。適當之分散劑為：例如木質亞硫酸鹽廢液與甲基纖維素。

調配劑中可使用增黏劑例如羧甲基纖維素及呈粉劑、粒劑或膠乳形式之天然及合成聚合物，例如阿拉伯膠、聚乙烯醇及聚乙酸乙烯酯，或天然磷脂類例如腦磷脂類與卵磷脂類，及合成磷脂類。其他可能的添加劑為礦物及植物油。

亦可使用著色劑例如無機色素，例如氧化鐵、氧化鈦與普魯士藍，及有機色料例如茜素色料、偶氮色料與金屬酞菁色料，及微量營養素例如鐵、錳、硼、銅、鈷、鉬與鋅等鹽。

調配劑通常含有 0.1 與 95%重量比間，較佳為 0.5 與 90%重量比間之活性化合物。

根據本發明之活性化合物可就其本身或呈其調配劑，及與已知殺真菌劑、殺細菌劑、殺蟎劑、殺線蟲劑或殺昆蟲劑混合使用，以擴大例如活性譜或防止抗性發展。於許多情形下，可獲得增效作用，亦即，混合物的活性比個別成分大。

適當之混合成分為，例如，下述化合物：

殺真菌劑：

2-苯基苯酚；8-羥基喹啉硫酸鹽；阿昔苯拉(acibenzolar)-S-

甲基；阿敵莫(aldimorph)；阿密氟美(amidoflumet)；安普洛松(ampropylfos)；安普洛松-鉀；安多林(andoprim)；安尼拉新(anilazine)；阿扎康唑(azaconazole)；亞佐敏(azoxystrobin)；貝那西(benalaxyl)；貝那西 M；倍達寧(benodanil)；免賴得(benomyl)；苯噻瓦卡(benthiavalicarb)-異丙基；倍雜麻利(benzamacril)；倍雜麻利-異丁基；必拉松(bialaphos)；秉那帕(binapacryl)；聯二苯；比多農(bitertanol)；保米黴素(blasticidin-S)；溴克座(bromuconazole)；布瑞莫(bupirimate)；得滅多(buthiobate)；丁基胺；多硫化鈣；蓋西黴素(capsimycin)；四氯丹(captafol)；蓋普丹(captan)；貝芬替(carbendazim)；加保新(carboxin)；加普胺(carpropamid)；克逢(carvon)；滿離丹(chinomethionat)；克氯塞松(chlobenthiazone)；克芬座(chlorfenazole)；克洛內(chloroneb)；四氯異苯(chlorothalonil)；克座利內(chlozolinate)；克濟康(clozylacon)；賽座滅(cyazofamid)；賽扶芬密(cyflufenamid)；克絕(cymoxanil)；賽洛克座(cyproconazole)；賽普洛(cyprodinil)；賽普蘭(cyprofuram)；Dagger G；第貝卡(debacarb)；益發靈(dichlofluanid)；二氯隆(dichlone)；二氯芬(dichlorophen)；二氯賽滅(diclocymet)；大滅淨(diclomezine)；大克爛(dicloran)；大索克(diethofencarb)；待克利(difenoconazole)；二氟林(diflumetorim)；敵滅莫(dimethirimol)；達滅芬(dimethomorph)；地莫敏(dimoxystrobin)；達克利

(diniconazole)；達克利-M；白粉克(dinocap)；二苯胺；地匹松(dipyrithione)；普得松(ditalimfos)；腈硫琨(dithianon)；多寧(dodine)；抓座隆(drazoxolon)；護粒松(edifenphos)；依普座(epoxiconazole)；依沙伯森(ethaboxam)；依瑞莫(ethirimol)；依得利(etridiazole)；飛莫冬(famoxadon)；非那米東(fenamidone)；芬帕尼(fenapanil)；芬瑞莫(fenarimol)；芬佈座(fenbuconazole)；芬福爛(fenfuram)；芬六密(fenhexamid)；芬尼潘(fenitropan)；芬諾尼(fenoxanil)；芬皮寧(fenpiclonil)；芬撲定(fenpropidin)；芬普福(fenpropimorph)；富爾邦(ferbam)；扶吉胺(fluazinam)；福苯明(flubenzimine)；護汰寧(fludioxonil)；護美福(flumetover)；氟嗎(flumorph)；福洛邁(fluoromide)；福挫敏(fluoxastrobin)；護康座(fluquinconazole)；護密多(flurprimidol)；護矽得(flusilazole)；護沙邁(flusulfamide)；福多寧(flutolanil)；護三福(flutriafol)；福爾培(folpet)；福賽得(fosetyl)-Al；福賽得-鈉；福達座(fuberidazole)；福拉西(furalaxyl)；福美拜(furametpyr)；護卡寧(furcarbanil)；福美洛(furmecyclox)；克熱淨(guazatine)；六氯苯；菲克利(hexaconazole)；殺紋寧(hymexazole)；依滅列(imazalil)；依本康座(imibenconazole)；亞胺辛丁(iminoctadine)三乙酸鹽；亞胺辛丁參(阿爾貝昔)[tris(albesil)]；碘克(iodocarb)；依康座(ipconazole)；丙基喜樂松(iprobenfos)；依普同(iprodione)；依普瓦卡(iprovalicarb)；依魯黴素

(irumamycin)；亞賜圃(isoprothiolane)；依瓦同(isovaledione)；嘉賜黴素(kasugamycin)；甲基瑞索新(kresoxim-methyl)；鋅錳乃浦(mancozeb)；錳乃浦(maneb)；美福松(meferimzone)；滅潘寧(mepanipyrim)；滅普寧(mepronil)；滅達樂(metalaxyl)；滅達樂-M；滅康座(metconazole)；滅殺克(methasulfocarb)；美福洛(methfuroxam)；免得爛(metiram)；美多敏(metominostrobin)；滅殺瓦(metsulfovax)；滅敵黴素(mildiomycin)；邁克尼(myclobutanil)；邁克林(myclozolin)；那他黴素(natamycin)；尼可芬(nicobifen)；異丙硝殺(nitrothal-isopropyl)；諾維隆(noviflumuron)；尼瑞莫(nuarimol)；歐福瑞(ofurace)；歐沙敏(orysastrobin)；毆殺斯(oxadixyl)；唑利酸(oxolinic acid)；歐頗座(oxpoconazole)；嘉保信(oxycarboxim)；芬喜辛(oxyfenthiin)；巴克素(paclobutrazole)；佩福座(pefurazoate)；平克座(penconazole)；賓克隆(pencycuron)；福敵芬(phosdiphen)；熱必斯(phthalide)；比考敏(picoxystrobin)；哌拉林(piperalin)；保力黴素(polyoxin)；保力寧(polyoxorim)；普本康座(probenazole)；撲克拉(prochloraz)；撲滅寧(procymidone)；普拔克(propamocarb)；鈉丙烷辛(propanosine-sodium)；普克利(propiconazole)；甲基鋅乃浦(propineb)；普羅奎濟(proquinazid)；普硫座(prothioconazole)；百克敏(pyraclostrobin)；白粉松(pyrazophos)；比芬諾(pyrifenox)；

必美寧(pyrimethanil)；百快隆(pyroquilon)；必喜福(pyroxyfur)；吡咯尼春(pyrrolnitrin)；快康座(quinconazole)；快諾芬(quinoxyfen)；快多真(quintozene)；西美康座(simeconazole)；螺沙明(spiroxamine)；硫；得克利(tebuconazole)；得洛爛(tecloftalam)；得那真(tecnazene)；得賽西(tetcyclacis)；四康座(tetraconazole)；腐絕(thiabendazole)；賜塞芬(thicyofen)；賜福邁(thifluzamide)；甲基多保淨(thiophanate-methyl)；得恩地(thiram)；地喜密(tioxymid)；甲基多樂松(tolclofos-methyl)；多利寧(tolylfluanid)；三泰芬(triadimefon)；三泰隆(triadimenol)；三佈敵(triazbutil)；三落賽(triazoxide)；三賽邁(tricyclamide)；三賽唑(tricyclazole)；三得芬(tridemorph)；三氟敏(trifloxystrobin)；賽福座(triflumizole)；賽福寧(triforine)；敵康座(triticonazole)；單康座(uniconazole)；華利達黴素(validamycin) A；免克寧(vinclozolin)；鋅乃浦(zineb)；濟爛(ziram)；唑沙邁(zoxamide)；(2S)-N-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔基]氧基]-3-甲氧苯基]乙基]-3-甲基-2-[(甲基磺醯基)胺基]丁醯胺；1-(1-萘基)-1H-吡咯-2,5-二酮；2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺醯基)吡啶；2-胺基-4-甲基-N-苯基-5-噻唑羧醯胺；2-氯-N-(2,3-二氯-1,1,3-三甲基-1H-茚-4-基)-3-吡啶羧醯胺；3,4,5-三氯-2,6-吡啶二甲腈；阿克維酸鹽(actinovate)；順式-1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-環庚醇；1-(2,3-二氫-2,2-二甲基-1H-茚-1-基)-1H-咪唑-5-

羧酸甲酯；碳酸氫鉀；N-(6-甲氧基-3-吡啶基)-環丙烷羧醯胺；N-丁基-8-(1,1-二甲基乙基)-1-氧雜螺[4.5]癸烷-3-胺；四硫代碳酸鈉；及銅鹽與製劑，例如 Bordeaux 混合物、氫氧化銅、環己烷甲酸銅、氧基氯化銅、硫酸銅、卡蘭內 (cufraneb)、氧化銅、錳銅 (mancopper)、快得寧 (oxine-copper)。

殺細菌劑：

佈諾普 (bronopol)、二氯芬 (dichlorophen)、耐措寧 (nitrapyrin)、二甲基二硫代胺基甲酸鎳、嘉賜黴素、歐西農 (octhilinone)、呋喃羧酸、氧基四環黴素、普本康座、鏈黴素、敵洛爛 (tecloftalam)、硫酸銅及其他銅製劑。

殺昆蟲劑/殺蟎劑/殺線蟲劑：

1. 乙醯膽鹼酯酶(AChE)抑制劑

1.1 胺基甲酸酯[例如亞拉克 (alanycarb)、得滅克 (aldicarb)、亞喜克 (aldoxycarb)、丙烯威 (allyxycarb)、滅害威 (aminocarb)、雜美松 (azamethiphos)、免敵克 (bendiocarb)、免扶克 (benfuracarb)、必克蝨 (bufencarb)、布塔克 (butacarb)、佈嘉信 (butocarboxim)、丁氧喜信 (butoxycarboxim)、加保利 (carbaryl)、加保扶 (carbofuran)、丁基加保扶 (carbosulphan)、氯索克 (chloethocarb)、可馬松 (coumaphos)、施力松 (cyanofenphos)、氰乃松 (cyanophos)、大滅替爛 (dimetilan)、愛殺克 (ethiofencarb)、丁基滅必蝨 (fenobucarb)、芬硫克 (fenothiocarb)、覆滅滿 (formetanate)、護拉克 (furathiocarb)、滅必蝨 (isoprocarb)、斯美地

(metam-sodium)、滅賜克(methiocarb)、納乃得(methomyl)、治滅蝨(metolcarb)、歐殺滅(oxamyl)、比加普(pirimicarb)、普滅克(promecarb)、安丹(propoxur)、硫敵克(thiodicarb)、硫化隆(thiofanox)、三雜滅(triazamate)、三美克(trimethacarb)、XMC、滅爾蝨(xylylcarb)]

1.2 有機磷酸酯[例如歐殺松(acephate)、雜美松(azamethiphos)、谷速松(azinphos)(-甲基、-乙基)、溴磷松(bromophos)-乙基、溴芬松(bromfenvinfos)-甲基、布硫松(butathiofos)、卡杜松(cadusafos)、加芬松(carbophenothion)、氯乙氧松(chlorethoxyfos)、氯芬松(chlorfenvinphos)、克美松(chlormephos)、陶斯松(chlorpyrifos)(-甲基/-乙基)、可馬松(coumaphos)、施力松(cyanofenphos)、氰基松(cyanophos)、滅賜松(demeton)-S-甲基、滅賜松-s-甲基碸、得拉松(dialifos)、大利松(diazinon)、二氯芬松(dichlofenthion)、二氯松(dichlorvos)/DDVP、雙特松(dicrotophos)、大滅松(dimethoate)、二甲基芬松(dimethylvinphos)、二噁苯松(dioxabenzofos)、二硫松(disulphoton)、EPN、愛殺松(ethion)、普伏松(ethoprophos)、益多松(etrimfos)、胺磺磷(famphur)、芬滅松(fenamiphos)、撲滅松(fenitrothion)、繁福松(fensulphothion)、芬殺松(fenthion)、氟吡唑松(flupyrazofos)、大福松(fonofos)、福木松(formothion)、松美爛(fosmethilan)、松賽殺(fosthiazate)、飛達松(heptenophos)、碘芬松(iodofenphos)、丙基喜樂松

(iprobenfos)、依殺松(isazofos)、亞芬松(isofenphos)、O-柳酸異丙酯、加福松(isoxathion)、馬拉松、滅加松(mecarbam)、滅克松(methacrifos)、達馬松(methamidophos)、滅大松(methidathion)、美文松(mevinphos)、亞素靈(monocrotophos)、那列(naled)、歐滅松(omethoate)、滅多松(oxydemeton)-甲基、巴拉松(-甲基/-乙基)、賽達松(phenthoate)、福瑞松(phorate)、裕必松(phosalone)、益滅松(phosmet)、福賜米松(phosphamidon)、磷克(phosphocarb)、巴賽松(phoxim)、亞特松(pirimiphos)(-甲基/-乙基)、佈飛松(profenofos)、加護松(propaphos)、撲達松(propetamphos)、普硫松(prothiofos)、飛克松(prothoate)、白克松(pyraclofos)、必芬松(pyridaphenthion)、必達松(pyridathion)、拜裕松(quinalphos)、西布松(sebufos)、硫帖(sulphotep)、沙洛松(sulprofos)、得寧松(tebupirimifos)、得美松(temephos)、托福松(terbufos)、樂本松(tetrachlorvinphos)、硫滅松(thiometon)、三落松(triazophos)、三氯松(triclorfon)、繁米松(vamidothion)]

2. 鈉通道調節劑/電壓依賴性鈉通道封阻劑

2.1 擬除蟲菊酯類[例如亞那寧(acrinathrin)、亞烈寧(allethrin)(d-順式-反式、d-反式)、β-賽扶寧(beta-cyfluthrin)、畢芬寧(bifenthrin)、百亞烈寧(bioallethrin)、百亞烈寧-S-環戊基-異構物、拜殺滅寧(bioethanomethrin)、拜帕滅寧(biopermethrin)、百烈滅寧

(bioresmethrin)、克瓦寧(chlovaporthrin)、順式賽滅寧(cis-cypermethrin)、順式烈滅寧、順式帕滅寧(cis-permethrin)、克洛賽寧(clocythrin)、環普洛寧(cycloprothrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、賽鹵寧(cyhalothrin)、賽滅寧(cypermethrin)(α-、β-、θ-、ξ-)、賽酚寧(cyphenothrin)、DDT、第滅寧(deltamethrin)、安潘寧(empenthrin)(1R-異構物)、益化利(esfenvalerate)、益多芬洛(etofenprox)、芬氟寧(fenfluthrin)、芬普寧(fenpropathrin)、芬拜寧(fenpyrithrin)、芬化利(fenvalerate)、護溴賽寧(flubrocythrinate)、護賽寧(flucythrinate)、福芬洛(flufenprox)、福美寧(flumethrin)、福利松(fluvalinate)、護芬洛(fubfenprox)、γ-賽鹵寧、依普寧(imiprothrin)、剋特寧(kadethrin)、λ-賽鹵寧、美托寧(metofluthrin)、百滅寧(permethrin)(順式-、反式-)、酚丁滅蝨(phenothrin)(1R-反式異構物)、普亞列寧(prallethrin)、普氟寧(profluthrin)、普三芬(protrifenbute)、拜滅寧(pyresmethrin)、烈滅寧(resmethrin)、RU 15525、西拉福芬(silafluofen)、τ-福利松、得福寧(tefluthrin)、環戊烯丙菊酯(terallethrin)、治滅寧(tetramethrin)(1R-異構物)、泰滅寧(tralomethrin)、拜富寧(transfluthrin)、ZXI 8901、除蟲菊酯類(除蟲菊粉)]

2.2 噁二咔類[例如因得克(indoxacarb)]

3. 乙醯膽鹼受體促效劑/拮抗劑

3.1 氯菸鹼醯基/新類菸鹼[例如醋密普利(acetamiprid)、可

尼丁(clothianidin)、達特南(dinotefuran)、益達胺(imidacloprid)、尼天爛(nitenpyram)、尼賽淨(nithiazine)、噻洛利(thiacloprid)、賽美索佔(thiamethoxam)]

3.2 菸鹼、免速達(bensultap)、培丹(cartap)

4. 乙醯膽鹼受體調節劑

4.1 賜諾辛類(spinosyns)[例如賜諾殺(spinosad)]

5. GABA 調控之氯化物通道拮抗劑

5.1 環二烯有機氯類[例如毒殺芬(camphechlor)、克氯丹(chlordane)、安殺番(endosulphan)、γ-HCH、HCH、飛佈達(heptachlor)、靈丹(lindane)、甲氧飛佈達(methoxychlor)]

5.2 苯基吡唑類[例如乙醯普洛(acetoprole)、愛殺普洛(ethiprole)、芬普尼(fipronil)、繁尼洛(vaniliprole)]

6. 氯化物通道活化劑

6.1 滅停類(mectins)[例如阿巴汀(abamectin)、亞滅停(avermectin)、益滅停(emamectin)、因滅汀(emamectin-benzoate)、、愛滅停(ivermectin)、密貝停(milbemectin)、米貝黴素(milbemycin)]

7. 青春激素模擬物

[例如二芬爛(diofenolan)、依普芬爛(epofenonane)、芬諾克(fenoxycarb)、氫普寧(hydroprene)、基諾普寧(kinoprene)、美索普寧(methoprene)、百利普芬(pyriproxifen)、三普寧(triprene)]

8. 蛻皮激素促效劑/干擾劑

8.1 二醯基肼類[例如克芬諾(chromafenozide)、鹵芬諾

(halofenozide)、甲氧芬諾(methoxyfenozide)、得芬諾(tebufenozide)]

9. 幾丁質生合成抑制劑

9.1 苯甲醯基脲類[例如雙三福隆(bistrifluron)、克福隆(chlofluazuron)、二福隆(diflubenzuron)、扶助隆(fluazuron)、福環隆(flucycloxuron)、福芬隆(flufenoxuron)、六伏隆(hexaflumuron)、路芬隆(lufenuron)、諾瓦隆(novaluron)、諾維隆(noviflumuron)、噴福隆(penfluron)、得福隆(teflubenzuron)、三福隆(triflumuron)]

9.2 布芬淨(buprofezin)

9.3 賽滅淨(cyromazine)

10. 氧化性磷酸化作用抑制劑、ATP 干擾劑

10.1 肽芬隆(diafenthiuron)

10.2 有機錫類[例如亞環錫(azocyclotin)、錫蟎丹(cyhexatin)、芬佈賜(fenbutatin oxide)]

11. 利用干擾 H-質子梯度而作用之氧化性磷酸化作用去偶聯劑

11.1 吡咯類[例如克凡派(chlorfenapyr)]

11.2 二硝基苯酚類[例如必諾派(binapacyrl)、大脫蟎(dinobuton)、白粉克(dinocap)、DNOC]

12. 側鏈-I 電子傳遞抑制劑

12.1 METI 類[例如芬殺蟎(fenazaquin)、芬普蟎(fenpyroximate)、畢米芬(pyrimidifen)、畢達本

(pryidaben)、得芬拜(tebufenpyrad)、托芬拜(tolfenpyrad)]

12.2 愛美松(hydramethylnon)

12.3 大克蟎(dicofol)

13. 側鏈-II 電子傳遞抑制劑

13.1 魚藤精(rotenone)

14. 側鏈-III 電子傳遞抑制劑

14.1 亞醌蟎(acequinocyl)、嘧蟎酯(fluacrypyrim)

15. 昆蟲腸膜之微生物干擾劑

蘇雲金芽孢桿菌(*Bacillus thuringiensis*)菌株

16. 脂肪合成抑制劑

16.1 4-羥乙醯乙酸內酯類[例如螺旋二氯芬(spirodiclofen)、螺旋麥西芬(spiromesifen)]

16.2 四聚酸類(tetramic acids)[例如 3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-酮基-1-氮雜螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙基碳酸酯(別名：碳酸 3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-酮基-1-氮雜螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙酯，CAS-Reg.-No.: 382608-10-8)與碳酸順式-3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-酮基-1-氮雜螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙酯，(CAS-Reg.-No.: 203313-25-1)]

17. 羧醯胺類

[例如福隆卡密(flonicamid)]

18. 章魚胺作用促效劑

[例如三亞蟎(amitraz)]

19. 受鎂激發的 ATP 酵素之抑制劑

[例如歐蟎多(propargite)]

20. 酞醯胺類

[例如 N^2-[1,1-二甲基-2-(甲基磺醯基)乙基]-3-碘-N^1-[2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基]-1,2-苯二羧醯胺 (CAS-Reg.-No.: 272451-65-7)，氟苯二醯胺 (flubendiamide)]

21. 沙蠶毒素類似物

[例如硫賜安草酸氫鹽、硫速達(thiosultap)-鈉]

22. 生物劑、激素或昆蟲性激素

[例如雜拉錫(azadirachtin)、桿菌屬(Bacillus)、白僵菌屬(Beauveria)、Codlemone 屬、綠僵菌屬(Metarrhizium)、擬青黴菌屬(Paecilomyces)、蘇雲金菌屬(Thuringiensin)、輪枝孢屬(Verticillium)等菌種]

23. 具有未知或不明確的作用機制之活性化合物

23.1 燻劑(例如磷化鋁、甲基溴、硫醯氟)

23.2 選擇性抗飼養劑[例如冰晶石(cryolite)、福隆卡密、拜滅淨(pymetrozine)]

23.3 蟎生長抑制劑[例如克洛賽寧(clofentezine)、益多康座(etoxazole)、合賽多(hexythiazox)]

23.4 阿密氟美、苯洛賽(benclothiaz)、西脫蟎(benzoximate)、必芬那(bifenazate)、新殺蟎(bromopropylate)、布芬淨、滿離丹、殺蟲脒(chlordimeform)、克氯苯(chlorobenzilate)、氯化苦(chloropicrin)、克噻苯(clothiazoben)、環普寧(cycloprene)、賽福芬(cyflumetofen)、二賽尼(dicyclanil)、芬殺寧

(fenoxacrim)、芬三尼(fentrifanil)、福苯明、福芬寧(flufenerim)、福添淨(flutenzin)、戈昔流(gossyplure)、愛美松、扎波流(japonilure)、滅多松(metoxadiazone)、石油、協力精(piperonyl butoxide)、油酸鉀、百福洛(pyrafluprole)、百大力(pyridalyl)、百利洛(pyriprole)、沙福拉密(sulphluramid)、得脫蟎(tetradifon)、殺蟎硫醚(tetrasul)、三拉森(triarathene)、維布亭(verbutin)、

再者，化合物丙基胺甲酸 3-甲基苯酯[速滅威(tsumacide) Z]、化合物 3-(5-氯-3-吡啶基)-8-(2,2,2-三氟乙基)-8-氮雜雙環[3.2.1]辛烷-3-甲腈(CAS-Reg. No. 185982-80-3)與對應之 3-內向-異構物(CAS-Reg. No. 185984-60-5)(參照 WO-96/37494、WO-98/25923)、及包含殺蟲活性植物抽取物、線蟲、真菌或病毒之製劑。

亦可為具有已知活性化合物(例如除草劑)，或具有肥料與生長調節劑、安全劑及/或化學傳訊素之混合物。

此外，根據本發明之式(I)化合物亦具有良好的抗真菌活性。彼等具有很寬廣的抗真菌活性譜，特別是對抗皮膚真菌與酵母、黴菌及雙相型真菌[例如對抗假絲酵母菌種如白假絲酵母(*Candida albicans*)、禿假絲酵母(*Candida glabrata*)及絮狀表皮癬菌(*Epidermophyton floccosum*)、曲黴菌種例如黑曲黴與烟曲黴(*Aspergillus fumigatus*)、髮癬菌菌種例如鬚髮癬菌(*Trichophyton mentagrophytes*)、小孢黴菌種例如狗小孢黴(*Microsporon canis*)與頭癬小孢黴(*Microsporon audouinii*)]。彼等真菌列表僅供說明用途，

決不擬對可涵蓋的真菌譜構成侷限。

活性化合物可就這樣、呈其調配劑形式或呈以其製備之使用形式(例如現成溶液、懸浮液、可濕性粉劑、糊劑、可溶性粉劑、粉塵與粒劑)使用。以習知方式進行施加，例如利用澆水、噴霧、霧化、撒播、噴撒、使成泡沫、塗敷等方式。再者，亦可利用超低容量法施加活性化合物或將活性化合物製劑或活性化合物本身注入土壤中。也可對植物種子進行處理。

當根據本發明之活性化合物作為殺真菌劑使用時，施加率視施用類別而定，可於相當寬廣範圍內有所不同。於處理部分植物體時，活性化合物施加率通常介於 0.1 與 10,000 g/ha 之間，較佳為介於 10 與 1000 g/ha 之間。處理種子時，活性化合物施加率每公斤種子通常介於 0.001 與 50 克之間，較佳為介於 0.01 與 10 克之間。處理土壤時，活性化合物施加率通常介於 0.1 與 10,000 g/ha 之間，較佳為介於 1 與 5000 g/ha 之間。

如上所述，根據本發明，得以處理所有植物及部分植物體。於較佳具體實例中，係處理野生植物及植物栽培品種、或利用習知生物育種(例如雜交或原生質體融合)獲得者、及部分植物體。於進一步之較佳具體實例中，則處理利用遺傳工程(適當時，則與習知方法組合)獲得之基因轉移植物及植物栽培品種(基因改造生物)，及部分植物體。「部分」或「部分植物體」等詞已於上文說明。

特佳為，根據本發明處理於各情形下市售可得或使用

中之植物栽培品種之植物。植物栽培品種欲被瞭解為意指具有新性質(「特性」)及係利用習知育種法、利用突變誘發法或利用重組DNA技術獲得之植物，其可為栽培品種、變種、遺傳因子型或基因型。

視植物種類或栽培品種、其位置及生長條件(土壤、氣候、植被期、養料)而異，根據本發明之處理亦可能產生超增加(「增效」)之效果。例如，超越實際預期效果之施加率減少及/或活性譜變廣及/或根據本發明可用之物質及組成物之活性增加、植物生長較佳、對高溫或低溫之耐性增加、對乾旱或對水或土壤鹽含量之耐性增加、花開得多、易於收割、加速成熟、收獲率較高、品質較佳及/或收成產品營養價值較高、貯存安定性及/或收成產品加工性較好等均可能發生。

較好根據本發明予以處理之基因轉移植物或植物栽培品種(亦即以遺傳工程方法獲得者)包含，於基因改造中，得到賦與該等植物特別有利之有用性質(「特性」)的遺傳物質之所有植物。此等性質之實例為植物生長較佳、對高溫或低溫之耐性增加、對乾旱或對水或土壤鹽含量之耐性增加、花開得多、易於收割、加速成熟、收獲率較高、品質較佳及/或收成產品營養價值較高、貯存安定性及/或收成產品加工性較好。此等性質之進一步及特別著重之實例為植物對抗動物及微生物害物(例如對抗昆蟲、蜱蟎、植物病原真菌、細菌及/或病毒)之防禦力較佳、以及植物對特定具除草活性化合物之耐性增加。可述及之基因轉移植物

之實例為重要收成作物，例如穀類(小麥、稻)、玉米、大豆、馬鈴薯、棉花、煙草、油菜及水果作物(蘋果、梨、柑橘類水果及葡萄)，特別是玉米、大豆、馬鈴薯、棉花、煙草及油菜。特別著重之特性為由於在植物中產生毒素，特別是由得自蘇雲金芽孢桿菌之遺傳物質[例如由CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb 與 CryIF 等基因以及其組合物]於植物中產生者(下文稱為「Bt植物」，使植物對昆蟲、蛛形綱動物、線蟲與蛞蝓及蝸牛之防禦力增加。又特別著重之特性為由於後天獲得之系統抗性(SAR)、系統素(systemin)、植物防禦素(phytoalexins)、誘引劑與抗性基因及對應之表現蛋白與毒素，使植物對真菌、細菌及病毒之防禦力增加。進一步特別著重之特性為植物對特定具除草活性化合物，例如咪唑啉酮、磺醯脲、嘉磷塞(glyphosate)或次膦醯麥黃酮(例如「PAT」基因)之耐性增加。賦與論及之所需特性之基因亦可互相組合而存在基因轉移植物中。可述及之「Bt植物」實例為以商品名 YIELD GARD®(例如玉米、棉花、大豆)、KnockOut®(例如玉米)、StarLink®(例如玉米)、Bollgard®(棉花)、Nucotn®(棉花)及 NewLeaf®(馬鈴薯)出售之玉米變種、棉花變種、大豆變種及馬鈴薯變種。可述及之對除草劑具耐性植物之實例為以商品名 Roundup Ready®(對嘉磷塞之耐性，例如玉米、棉花、大豆)、Liberty Link®(對次膦醯麥黃酮具耐性，例如油菜)、IMI®(對咪唑啉酮具耐性)及 STS®(對磺醯脲具耐性，例如

玉米)出售之玉米變種、棉花變種及大豆變種。可述及之對除草劑具耐性之植物(以習知方法針對除草劑耐性育種之植物)包含以商品名 Clearfield®(例如玉米)出售之變種。當然，這些敘述亦可應用於具有此等遺傳特性或仍待開發之遺傳特性之植物栽培品種，該等植物未來將開發及/或上市。

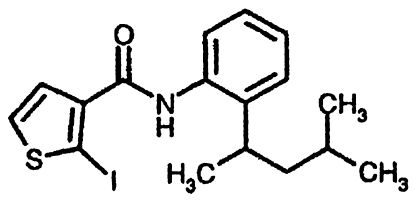
所列植物可以特別有利之方法，使用根據本發明之式(I)化合物或活性化合物混合物，根據本發明予以處理。活性化合物或混合物之上述較佳範圍亦可應用於該等植物之處理。特別著重於以本文詳述之化合物或混合物進行植物之處理。

茲以下文實例說明根據本發明活性化合物之製備及使用。

【實施方式】

製備實例

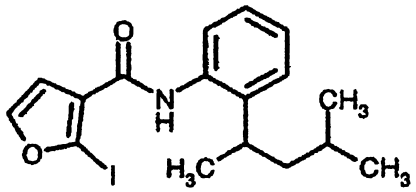
實例 1



於保護氣體(氬氣)氛圍下，添加 0.56 毫升(3.38 毫莫耳) *N,N*-二異丙基乙胺與 1.18 克(2.5 毫莫耳)六氟磷酸溴參吡咯烷鏻(PyBrop)至含 516 毫克(2.0 毫莫耳) 2-碘噻吩-3-羧酸與 300 毫克(1.7 毫莫耳) 2-(1,3-二甲基丁基)苯基胺之 10 毫升乙腈溶液中。於室溫攪拌反應混合物 24 小時，供檢驗用

時，添加至水中，以乙酸乙酯萃取，以硫酸鈉脫水，減壓濃縮。進行管柱層析法(環己烷/乙酸乙酯梯度)後，得到 150 毫克(21%理論值) N-[2-(1,3-二甲基丁基)苯基]-2-碘噻吩-3-羧醯胺[log P (pH 2.3) = 4.14]。

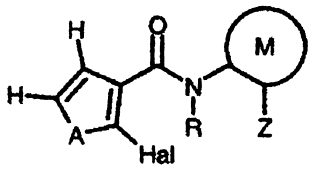
實例 2



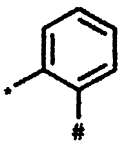
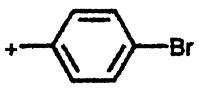
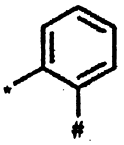
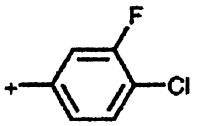
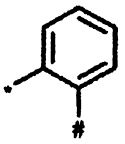
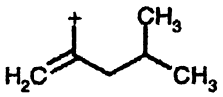
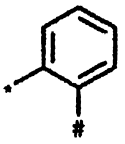
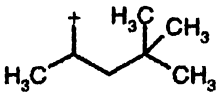
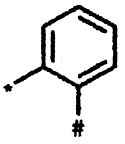
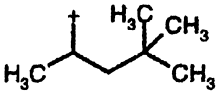
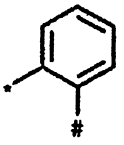
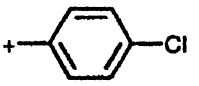
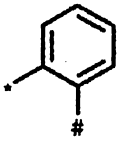
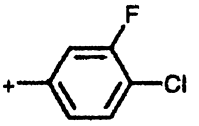
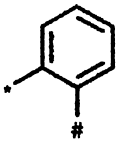
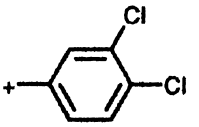
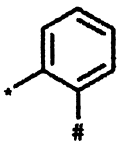
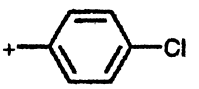
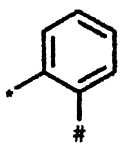
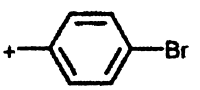
於保護氣體(氬氣)氛圍下，添加 0.56 毫升(3.38 毫莫耳) *N,N*-二異丙基乙胺與 1.18 克(2.5 毫莫耳)六氟磷酸溴參吡咯烷鏻(PyBrop)至含 483 毫克(2.02 毫莫耳) 2-碘呋喃-3-羧酸與 300 毫克(1.7 毫莫耳) 2-(1,3-二甲基丁基)苯基胺之 10 毫升乙腈溶液中。於室溫攪拌反應混合物 24 小時，供檢驗用時，添加至水中，以乙酸乙酯萃取，以硫酸鈉脫水，減壓濃縮。進行管柱層析法(環己烷/乙酸乙酯梯度)後，得到 130 毫克(18%理論值) N-[2-(1,3-二甲基丁基)苯基]-2-碘-3-呋喃醯胺[log P (pH 2.3) = 3.88]。

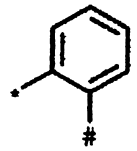
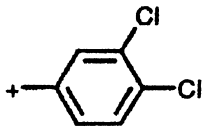
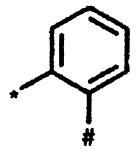
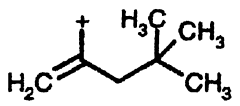
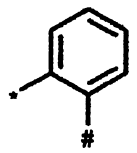
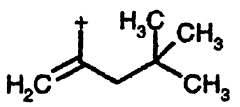
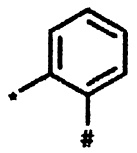
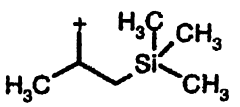
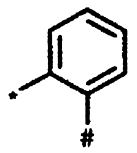
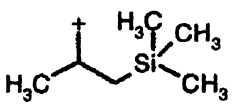
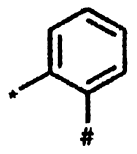
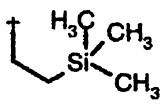
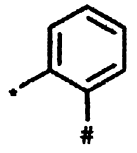
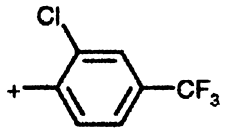
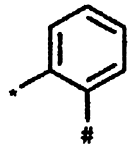
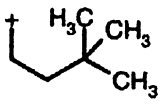
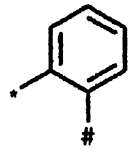
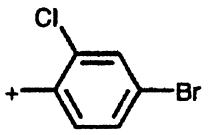
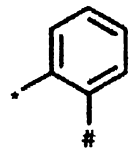
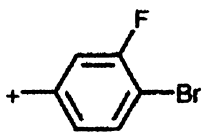
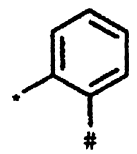
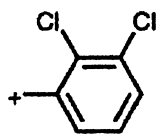
下文表 1 所列式(I)化合物亦係以類似實例 1 與 2 之方法及根據本發明製法(a)至(h)一般敘述中之細節製得：

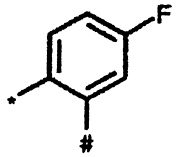
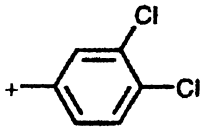
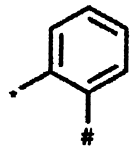
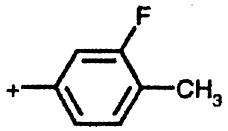
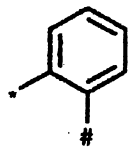
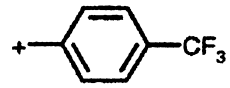
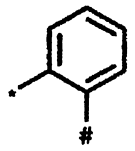
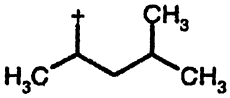
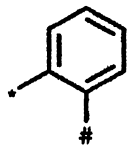
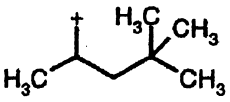
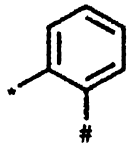
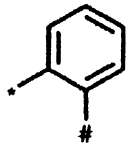
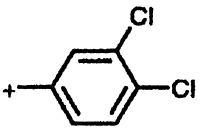
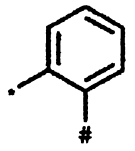
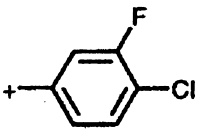
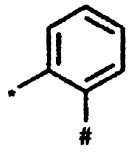
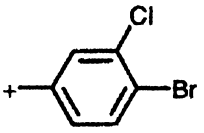
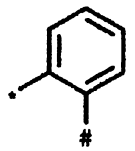
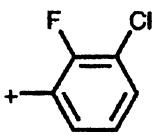
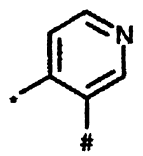
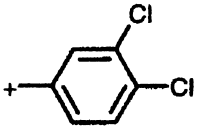
表1

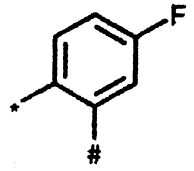
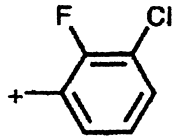
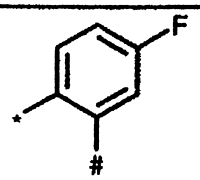
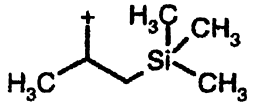
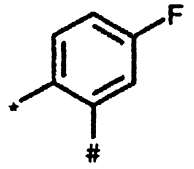
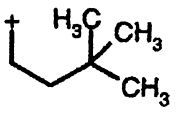
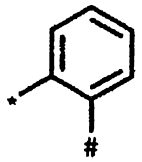
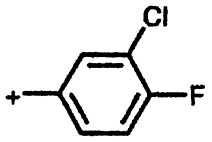
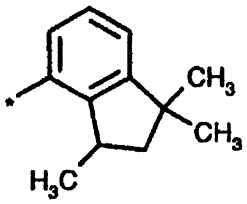
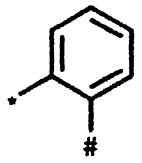
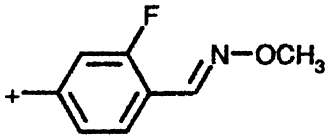
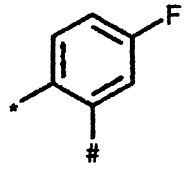
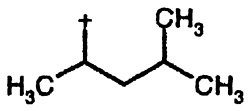
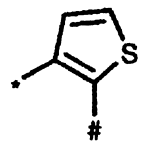
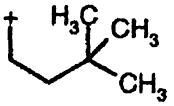
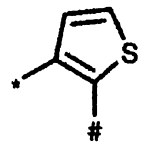
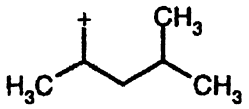
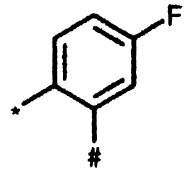
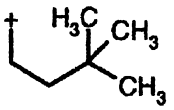


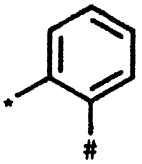
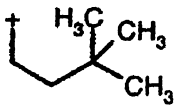
(I),

No.	A	Hal	R	M[a)]	Z[b)]	logP
3	O	I	H			3.72
4	O	I	H			3.58
5	S	I	H			4.57
6	S	I	H			4.42
7	O	I	H			4.16
8	S	I	H			3.93
9	S	I	H			3.82
10	O	I	H			3.89
11	O	I	H			3.62
12	S	I	H			3.94

No.	A	Hal	R	M[a)]	Z[b)]	logP
13	S	I	H			4.11
14	S	I	H			4.78
15	O	I	H			4.49
16	O	I	H			4.45
17	S	I	H			4.69
18	S	I	H			4.43
19	S	I	H			4.18
20	S	I	H			4.17
21	S	I	H			4.28
22	S	I	H			3.89
23	S	I	H			4.01

No.	A	Hal	R	M[a)]	Z[b)]	logP
24	S	I	H			4.13
25	S	I	H			3.89
26	S	I	H			3.89
27	S	Br	H			4.24
28	S	Br	H			4.51
29	S	Br	H			3.99
30	S	Br	H			4.25
31	S	Br	H			3.91
32	S	I	H			4.21
33	S	I	H			3.67
34	S	I	H			2.20

No.	A	Hal	R	M[a)]	Z[b)]	logP
35	S	I	H			3.69
36	S	I	H			4.67
37	S	I	H			4.16
38	S	I	H			3.79
39	S	I	H			4.09
40	S	I	H			3.79
41	S	I	H			4.17
42	S	I	H			4.44
43	S	I	H			4.22
44	S	Br	H			4.30

No.	A	Hal	R	M[a)]	Z[b)]	logP
45	S	Br	H			4.30

[a)] 標示「*」之鍵係連接於醯胺；標示「#」之鍵係連接於Z基團。

[b)] 標示「+」之鍵係連接於M基團。

logP數值係根據EEC Directive 79/831 Annex V.A8，於逆相管柱(C 18)上利用 HPLC (高效能液相層析法)予以測定。溫度：43℃。

於酸性範圍(pH 2.3)測定用移動相：0.1%磷酸水溶液、乙腈；自10%乙腈至90%乙腈之線性梯度。

使用具已知 logP 數值之直鏈烷-2-酮類(具有 3 至 16 個碳原子)進行校正(使用線性內插法利用兩個接續烷酮類間之駐留時間測定 logP)。

λ-最大數值係使用200奈米至400奈米之UV光譜，以層析訊號之最大值測定。

使用實例

實例 A

單絲殼菌試驗(黃瓜)/防護性

溶劑： 24.5 重量份丙酮

24.5 重量份二甲基乙醯胺

乳化劑： 1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

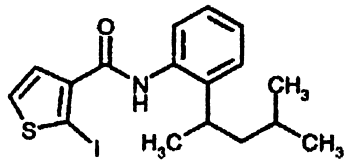
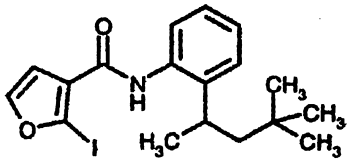
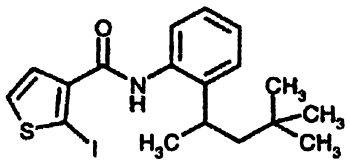
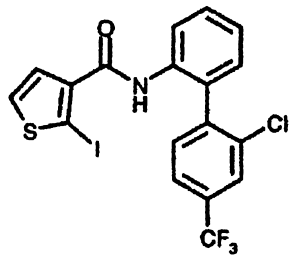
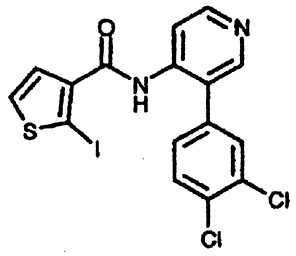
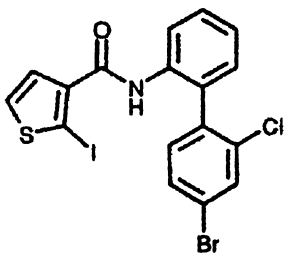
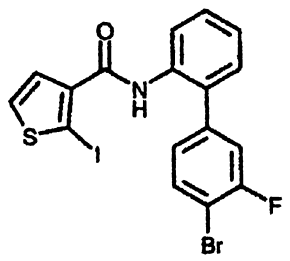
為了製造活性化合物之適當製劑，使 1 重量份活性化合物與所述量溶劑及乳化劑混合，以水稀釋此濃縮物至所需濃度。

為了測試防護活性，以所述施加率對幼植物噴灑活性化合物製劑。待噴灑塗層乾燥後，將蒼耳單絲殼(*Sphaerotheca fuliginea*)的孢子懸浮水溶液接種於植物。然後將植物放置於約 23℃及相對大氣濕度約 70%之溫室中。

接種 7 天後，進行評估。0%意指效力與對照組相當，而 100%效力意指未觀察到感染。

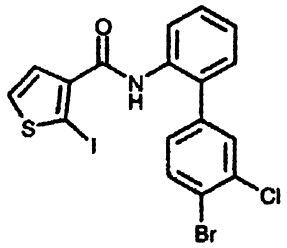
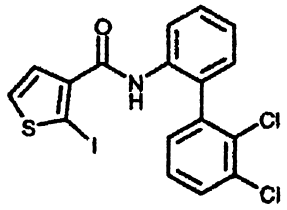
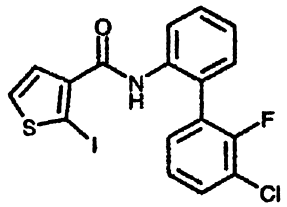
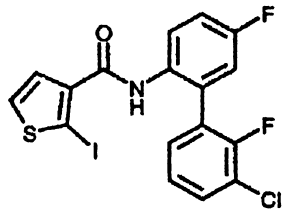
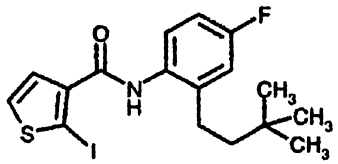
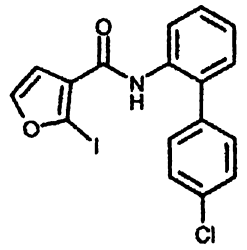
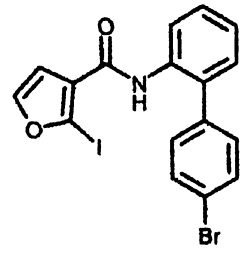
表A

單絲殼菌試驗(黃瓜)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	100	98
	100	98
	100	100
	100	100
	100	100
	100	100
	100	100

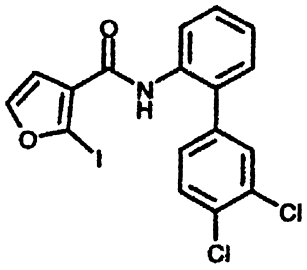
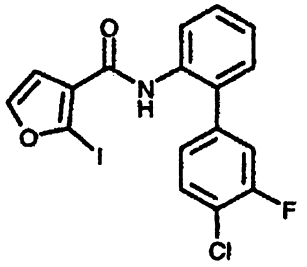
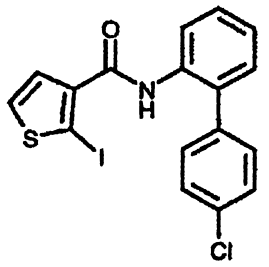
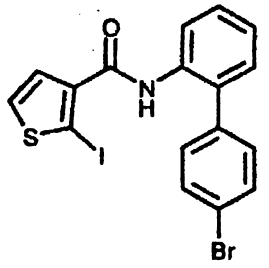
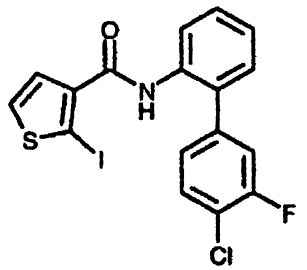
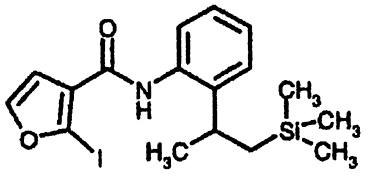
表A

單絲殼菌試驗(黃瓜)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	100	100
	100	100
	100	100
	100	100
	100	100
	100	100
	100	100

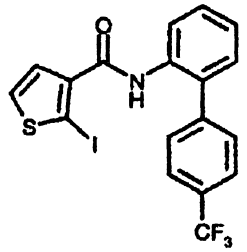
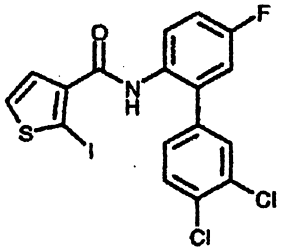
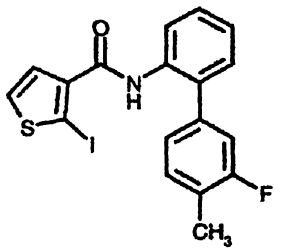
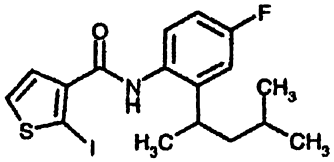
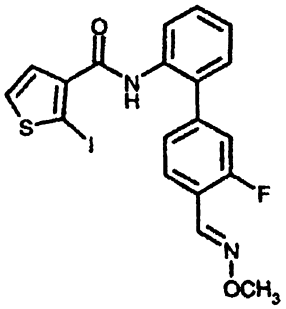
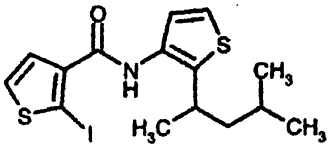
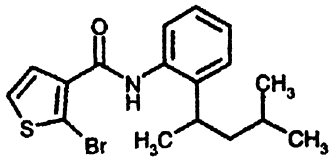
表A

單絲殼菌試驗(黃瓜)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	100	100
	100	98
	100	95
	100	100
	100	98
	100	100

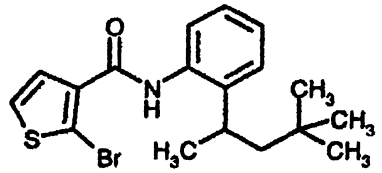
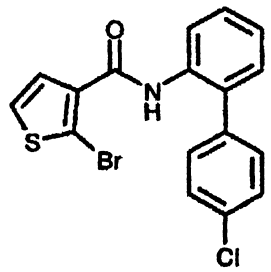
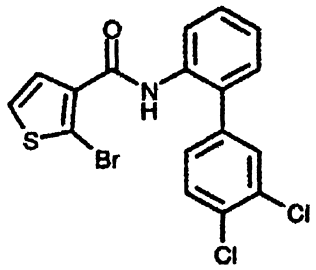
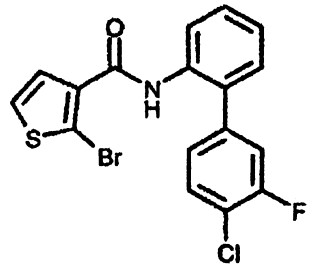
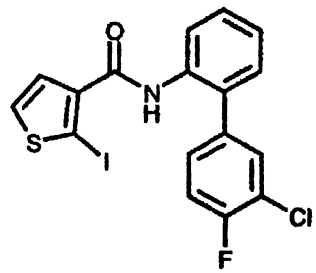
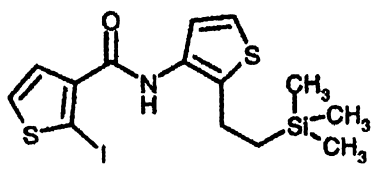
表A

單絲殼菌試驗(黃瓜)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	100	93
	100	100
	100	100
	100	97
	100	98
	100	92
	100	100

表A

單絲殼菌試驗(黃瓜)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	100	97
	100	100
	100	100
	100	100
	100	100
	100	100

實例 B

黑星菌試驗(蘋果)/防護性

溶劑： 24.5 重量份丙酮

24.5 重量份二甲基乙醯胺

乳化劑： 1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

為了製造活性化合物之適當製劑，使 1 重量份活性化合物與所述量溶劑及乳化劑混合，以水稀釋此濃縮物至所需濃度。

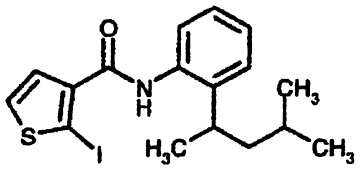
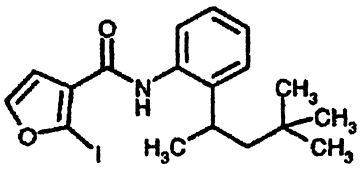
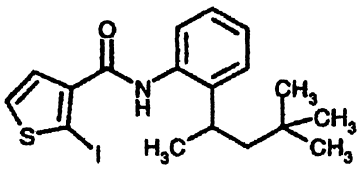
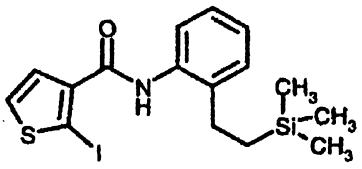
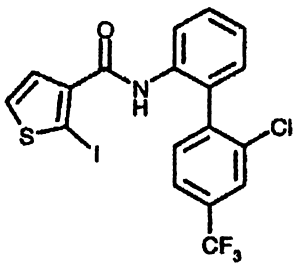
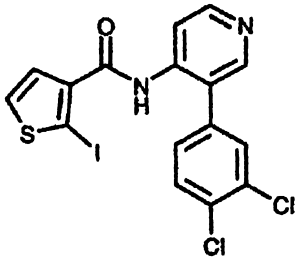
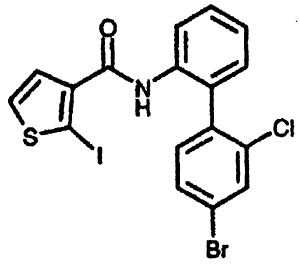
為了測試防護活性，以所述施加率對幼植物噴灑活性化合物製劑。待噴灑塗層乾燥後，將蘋果斑點症病原菌蘋果黑星菌(*Venturia inaequalis*)的分生孢子懸浮水溶液接種於植物，接著於約 20℃及相對大氣濕度 100%之培育室中維持 1 天。

然後將植物放置於約 21℃及相對大氣濕度約 90%之溫室中。

接種 10 天後，進行評估。0%意指效力與對照組相當，而 100%效力意指未觀察到感染。

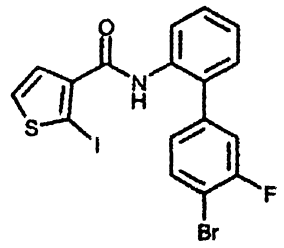
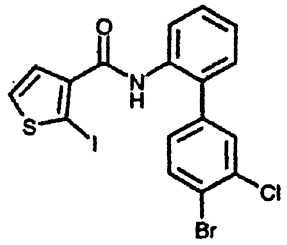
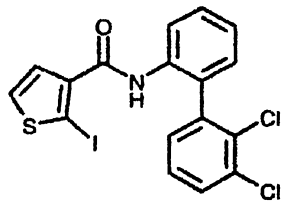
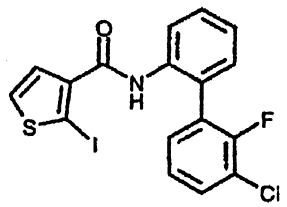
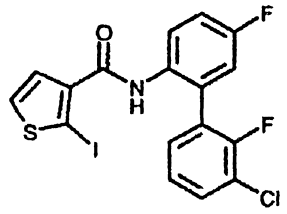
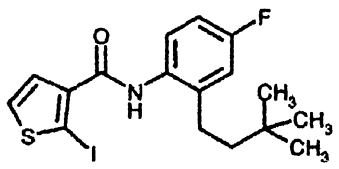
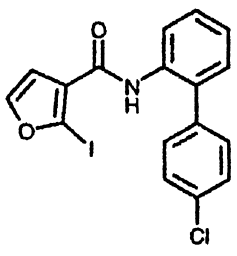
表B

黑星菌試驗(蘋果)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	100	100
	100	94
	100	100
	100	100
	100	97
	100	98
	100	100

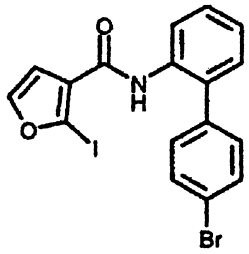
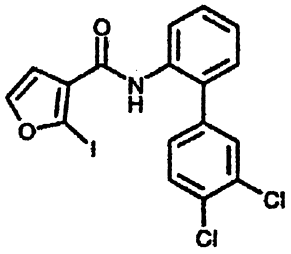
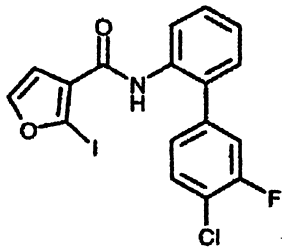
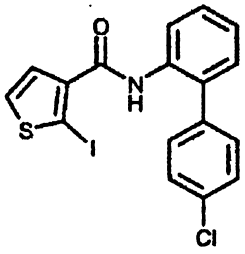
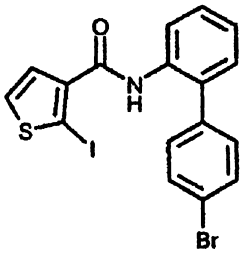
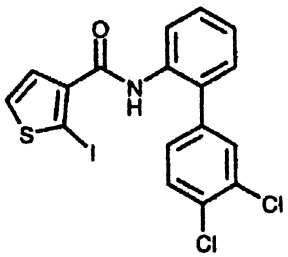
表B

黑星菌試驗(蘋果)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	100	100
	100	100
	100	98
	100	89
	100	100
	100	100
	100	100

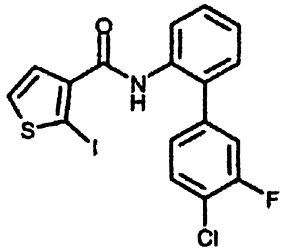
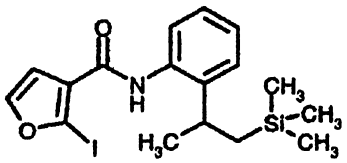
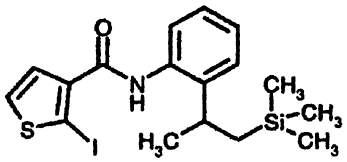
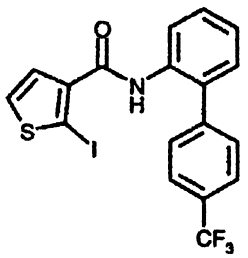
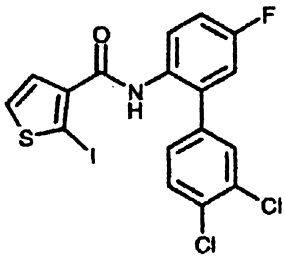
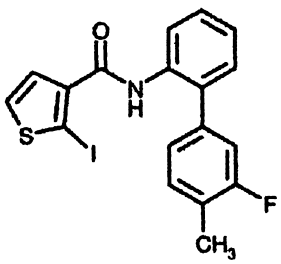
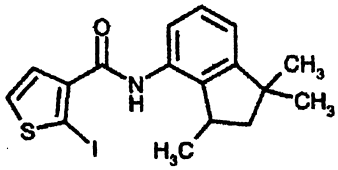
表B

黑星菌試驗(蘋果)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	100	100
	100	99
	100	100
	100	100
	100	91
	100	100

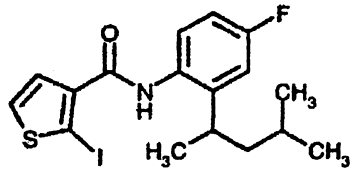
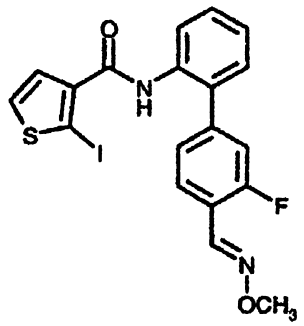
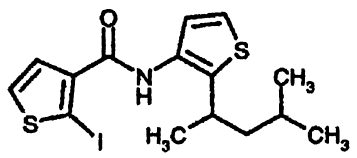
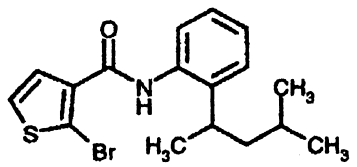
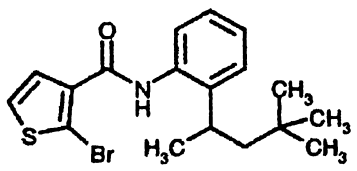
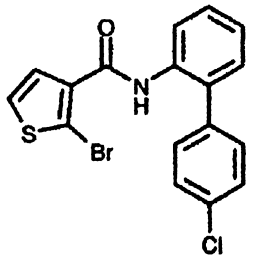
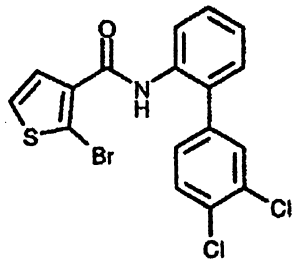
表B

黑星菌試驗(蘋果)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	100	100
	100	99
	100	100
	100	99
	100	100
	100	100
	100	100

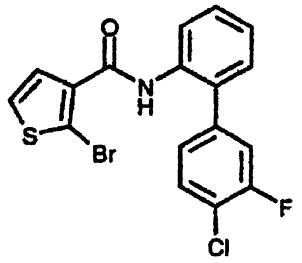
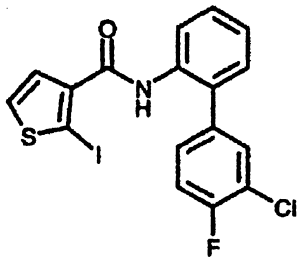
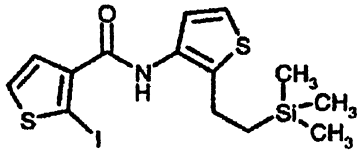
表B

黑星菌試驗(蘋果)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	100	100
	100	100
	100	100
	100	100
	100	98
	100	100
	100	100

表B

黑星菌試驗(蘋果)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	100	100
	100	100
	100	100

實例 C

葡萄孢試驗(豆類)/防護性

溶劑：　24.5 重量份丙酮

24.5 重量份二甲基乙醯胺

乳化劑：　1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

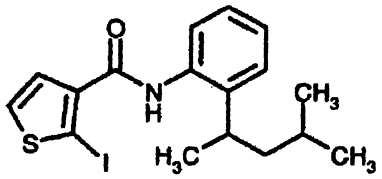
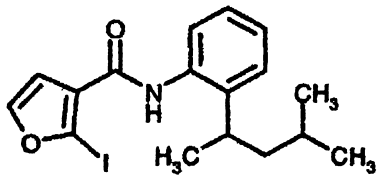
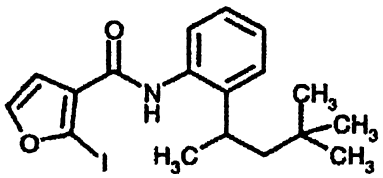
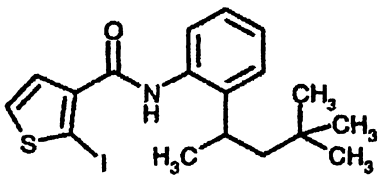
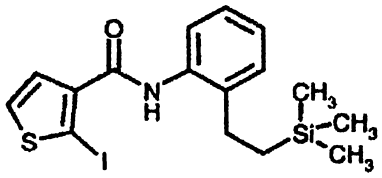
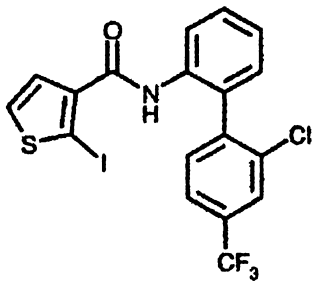
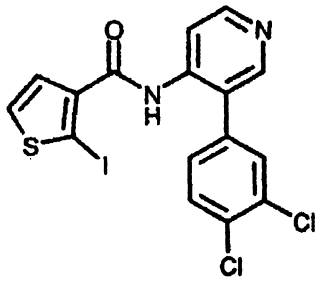
為了製造活性化合物之適當製劑，使 1 重量份活性化合物與所述量溶劑及乳化劑混合，以水稀釋此濃縮物至所需濃度。

為了測試防護活性，以所述施加率對幼植物噴灑活性化合物製劑。待噴灑塗層乾燥後，將被灰葡萄孢(*Botrytis cinerea*)菌落化的兩小片洋菜各置於一葉片上。將接菌後之植物放置於約 20℃及 100%相對大氣濕度之暗室中。

自接菌起 2 天後，評估葉片上感染的面積大小。0%意指效力與對照組相當，而 100%效力意指未觀察到感染。

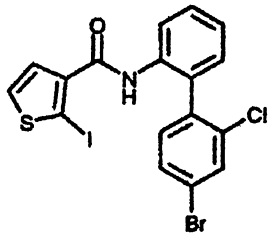
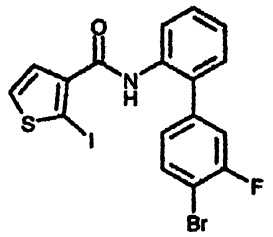
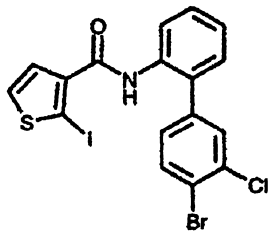
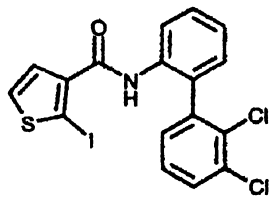
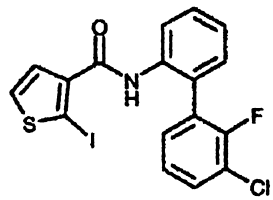
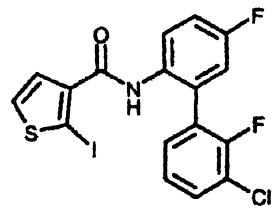
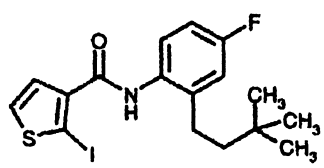
表C

葡萄孢試驗(豆類)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	500	100
	500	99
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

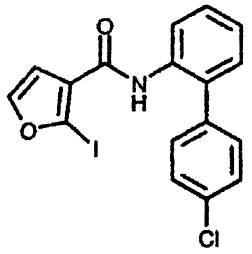
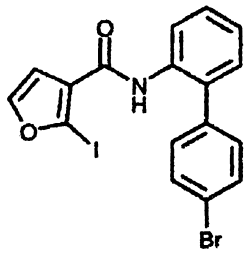
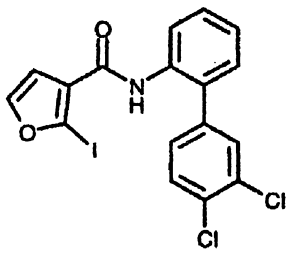
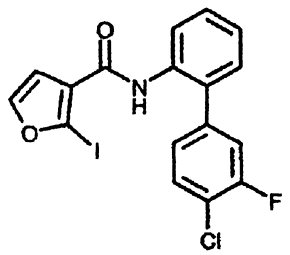
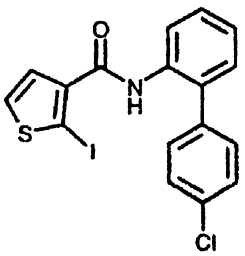
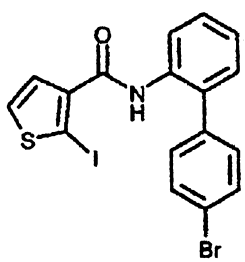
表C

葡萄孢試驗(豆類)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

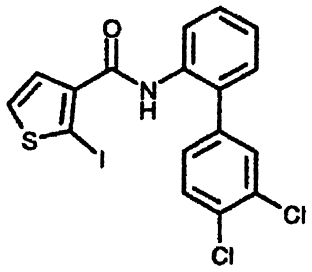
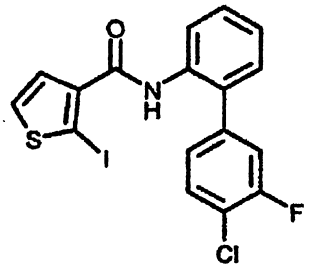
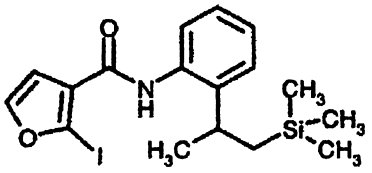
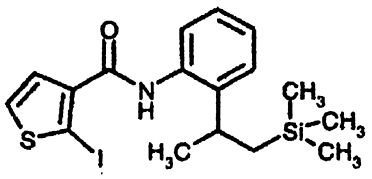
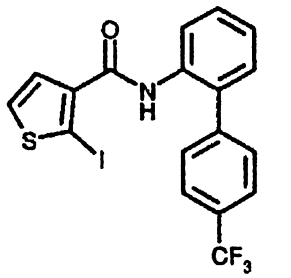
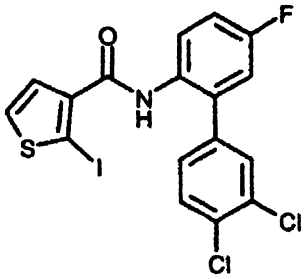
表C

葡萄孢試驗(豆類)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

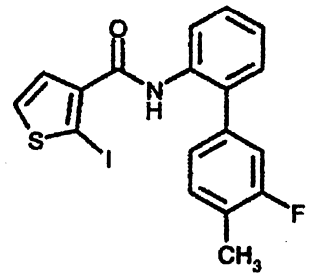
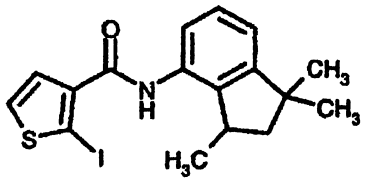
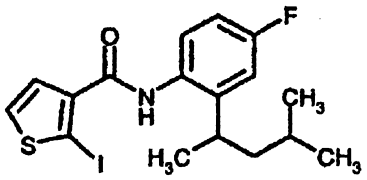
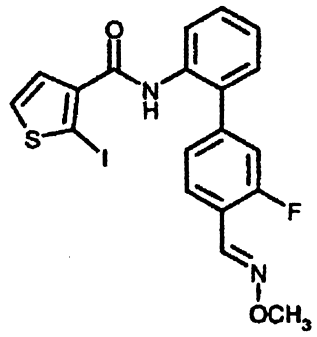
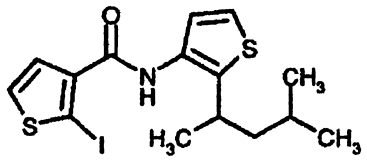
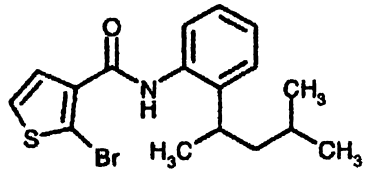
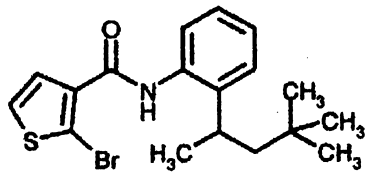
表C

葡萄孢試驗(豆類)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

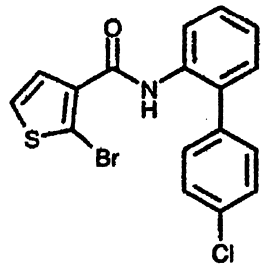
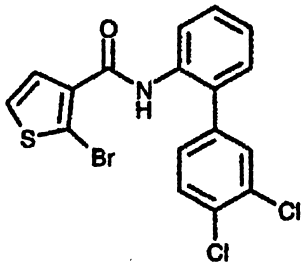
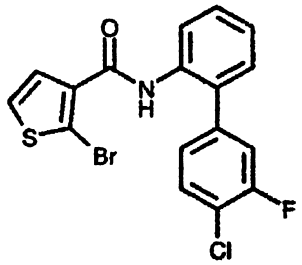
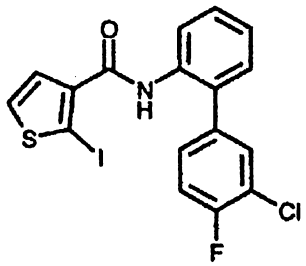
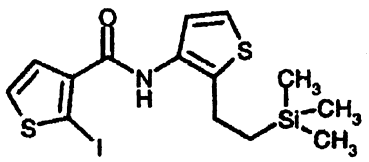
表C

葡萄孢試驗(豆類)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

表C

葡萄孢試驗(豆類)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	500	100
	500	100
	500	100
	500	99
	500	100

實例 D

柄銹菌試驗(小麥)/防護性

溶劑：　　50 重量份 N,N-二甲基乙醯胺

乳化劑：　　1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

為了製造活性化合物之適當製劑，使 1 重量份活性化合物與所述量溶劑及乳化劑混合，以水稀釋此濃縮物至所需濃度。

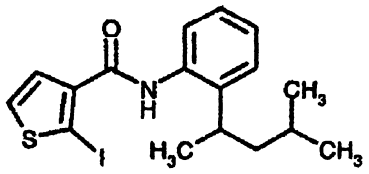
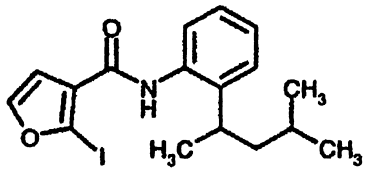
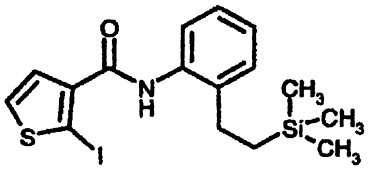
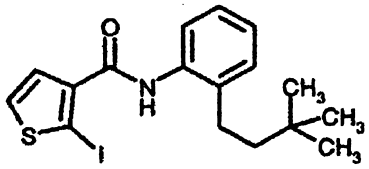
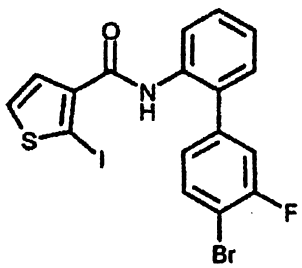
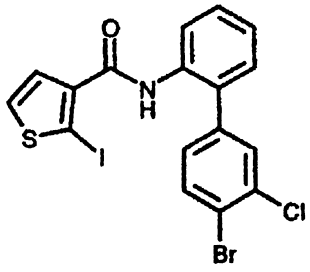
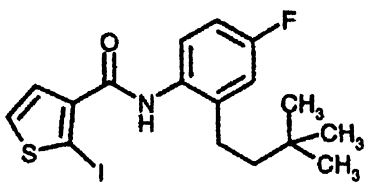
為了測試防護活性，以所述施加率對幼植物噴灑活性化合物製劑。待噴灑塗層乾燥後，以隱匿柄銹菌(*Puccinia recondita*)之分生孢子懸浮液噴灑植物。使植物於 20℃及 100%相對大氣濕度之培育室中維持 48 小時。

然後將植物放置於溫度約 20℃及相對大氣濕度 80%之溫室中，促進銹菌疱狀突起形成。

接菌 10 天後，進行評估。0%意指效力與對照組相當，而 100%效力意指未觀察到感染。

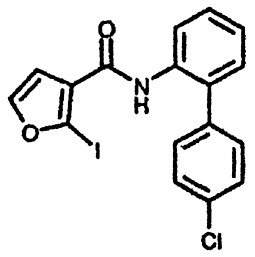
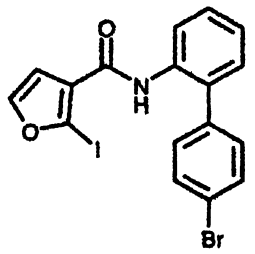
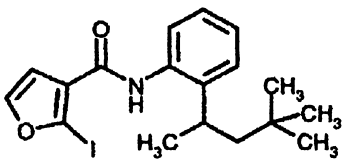
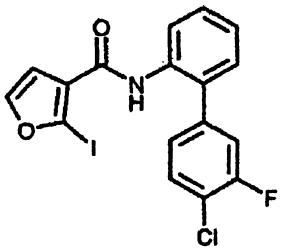
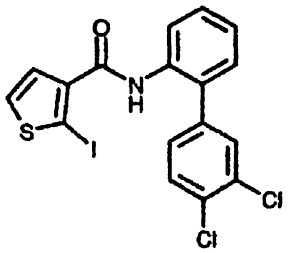
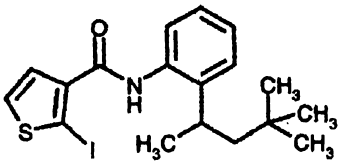
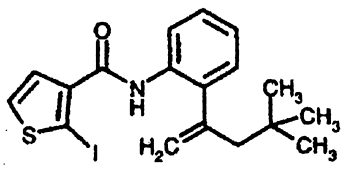
表D

柄銹菌試驗(小麥)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	500	100
	500	100
	500	97
	500	97
	500	100
	500	100
	500	100

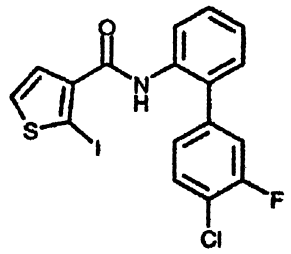
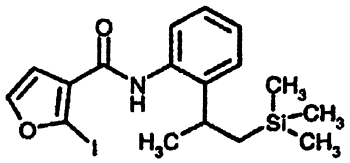
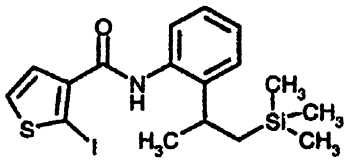
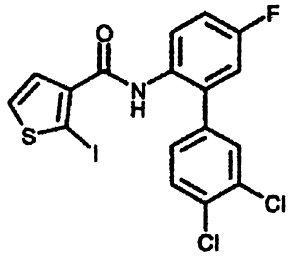
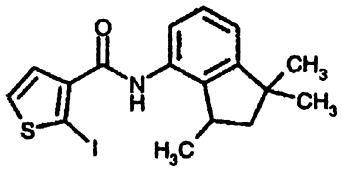
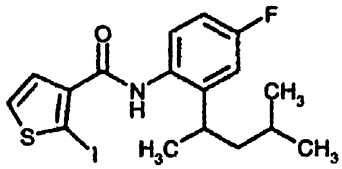
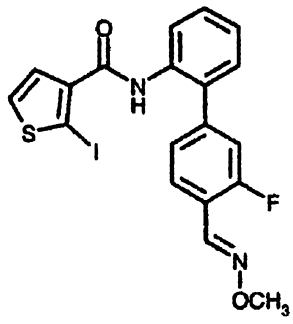
表D

柄銹菌試驗(小麥)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	93

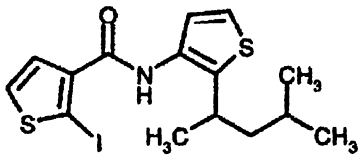
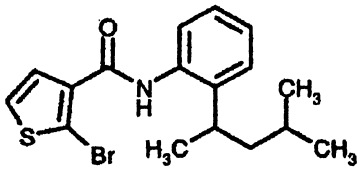
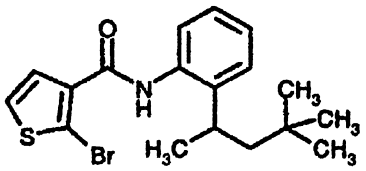
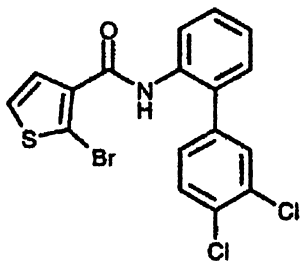
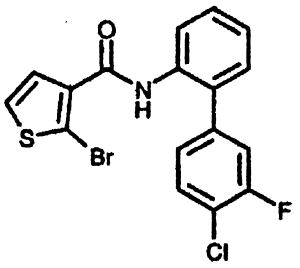
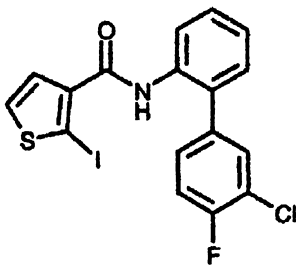
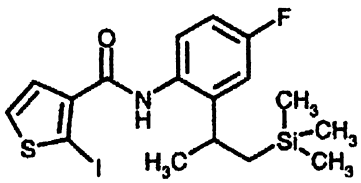
表D

柄銹菌試驗(小麥)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	500	94
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

表D

柄銹菌試驗(小麥)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

實例 E

鏈格孢試驗(番茄)/防護性

溶劑：　　49 重量份 N,N-二甲基甲醯胺

乳化劑：　　1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

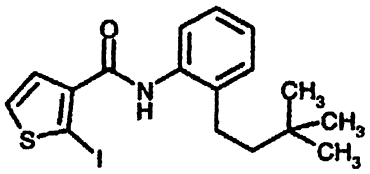
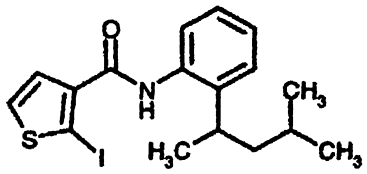
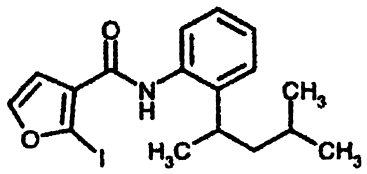
為了製造活性化合物之適當製劑，使 1 重量份活性化合物與所述量溶劑及乳化劑混合，以水稀釋此濃縮物至所需濃度。

為了測試防護活性，以所述施加率對番茄幼植物噴灑活性化合物製劑。處理一天後，將立枯鏈格孢(*Alternaria solani*)的孢子懸浮液接種於植物，接著維持於 100%相對濕度及 20℃ 24 小時。然後使植物維持於 96%相對大氣濕度及溫度 20℃。

接種 7 天後，進行評估。0%意指效力與對照組相當，而 100%效力意指未觀察到感染。

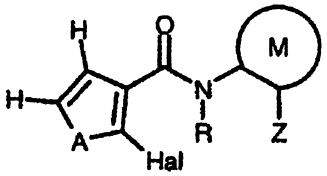
表E

鏈格孢試驗(番茄)/防護性

根據本發明之活性化合物	活性化合物施加率 (g/ha)	效力 (%)
	750	94
	750	100
	750	94

五、中文發明摘要：

本發明乃有關具下式(I)之新穎之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



(I)

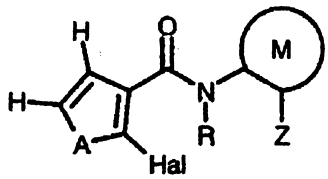
式中

A、Hal、R、M與Z如說明書中之界定，

有關其等化合物之許多製備方法及其作為防治有害微生物之用途，亦有關新穎之中間產物及其製備。

六、英文發明摘要：

Novel 2-halofuryl/thienyl-3-carboxamides of the formula (I)



(I),

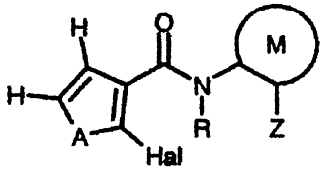
in which

A, Hal, R, M and Z are as defined in the description,

a plurality of processes for preparing these compounds and their use for controlling unwanted microorganisms, and also novel intermediates and their preparation.

十、申請專利範圍：

1. 一種具下式(I)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



(I)

式中

A　代表 O (氧)或 S (硫)，

Hal　代表鹵素，

R　代表氫、C_1-C_8-烷基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_3-C_8-環烷基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_6-鹵烷基、C_1-C_4-鹵烷基硫基、C_1-C_4-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_3-C_8-鹵基環烷基；甲醯基、甲醯基-C_1-C_3-烷基、(C_1-C_3-烷基)羰基-C_1-C_3-烷基、(C_1-C_3-烷氧基)羰基-C_1-C_3-烷基；各具有 1 至 13 個氟、氯及/或溴原子之鹵基-(C_1-C_3-烷基)羰基-C_1-C_3-烷基、鹵基-(C_1-C_3-烷氧基)羰基-C_1-C_3-烷基；

(C_1-C_8-烷基)羰基、(C_1-C_8-烷氧基)羰基、(C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基)羰基、(C_3-C_8-環烷基)羰基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之(C_1-C_6-鹵烷基)羰基、(C_1-C_6-鹵基烷氧基)羰基、(鹵基-C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基)羰基、(C_3-C_8-鹵基環烷基)羰

基；或-C(=O)C(=O)R^1、-CONR^{2}R^{3}或-CH$_2$NR^{4}R^5，

R^1 代表氫、C_1-C_8-烷基、C_1-C_8-烷氧基、C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_3-C_8-環烷基；各具有1至9個氟、氯及/或溴原子之C_1-C_6-鹵烷基、C_1-C_6-鹵基烷氧基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_3-C_8-鹵基環烷基，

R^2與R^3彼此獨立地各代表氫、C_1-C_8-烷基、C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_3-C_8-環烷基；各具有1至9個氟、氯及/或溴原子之C_1-C_8-鹵烷基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_3-C_8-鹵基環烷基，

R^2與R^3進一步和與其連接之氮原子一起形成具有5至8個環原子之飽和雜環，其視需要被得自包括鹵素與C_1-C_4-烷基之組群之相同或不同取代基單或多取代，其中雜環可含有一個或兩個另外之得自包括氧、硫與NR^{6}之組群之不相鄰雜原子，

R^4與R^5彼此獨立地代表氫、C_1-C_8-烷基、C_3-C_8-環烷基；各具有1至9個氟、氯及/或溴原子之C_1-C_8-鹵烷基、C_3-C_8-鹵基環烷基，

R^4與R^5進一步和與其連接之氮原子一起形成具有5至8個環原子之飽和雜環，其視需要被得自包括鹵素與C_1-C_4-烷基之組群之相同或不同取代基單或多取代，其中雜環可含有1或2個另外之得自包括氧、硫與NR^{6}之組群之不相鄰雜原子，

R^6 代表氫或C_1-C_6-烷基，

M 代表苯基、噻吩、吡啶、嘧啶、嗒吡或吡吡環，各者被 R^7 單取代，或代表被 R^{7-A} 取代之噻唑環，

R^7 代表氫、氟、氯、甲基、異丙基、甲硫基或三氟甲基，

R^{7-A} 代表氫、甲基、甲硫基或三氟甲基，

Z 代表 Z^1、Z^2、Z^3 或 Z^4，其中

Z^1 代表苯基，其視需要被相同或不同取代基單-至五取代，

Z^2 代表雙環烷基或環烷基，其視需要被相同或不同取代基單或多取代，

Z^3 代表未經取代之 C_2-C_{20}-烷基或代表 C_1-C_{20}-烷基，其視需要被選自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：鹵素、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、鹵烷基硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基、鹵基二烷胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$ 與 C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被選自包括鹵素與 C_1-C_4-烷基之組群之相同或不同取代基單或多取代，

Z^4 代表 C_2-C_{20}-烯基或 C_2-C_{20}-炔基，各者視需要被選自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：鹵素、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、鹵烷基硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷

胺基、鹵基二烷胺基、-$SiR^8R^9R^{10}$與 C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被選自包括鹵素與 C_1-C_4-烷基之組群之相同或不同取代基單或多取代，

R^8與 R^9彼此獨立地代表氫、C_1-C_8-烷基、C_1-C_8-烷氧基、C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷硫基-C_1-C_4-烷基或 C_1-C_6-鹵烷基，

R^{10} 代表氫、C_1-C_8-烷基、C_1-C_8-烷氧基、C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷硫基-C_1-C_4-烷基、C_2-C_8-烯基、C_2-C_8-炔基、C_1-C_6-鹵烷基、C_2-C_6-鹵烯基、C_2-C_6-鹵炔基、C_3-C_6-環烷基，或代表各者視需要經取代之苯基或苯基烷基，

或

M與 Z 一起代表 1H-2,3-二氫茚-4-基、1,3-二氫-2-苯並呋喃-4-基或 1,3-二氫-2-苯並噻吩-4-基，各者視需要被甲基單至三取代。

2. 根據申請專利範圍第 1 項之式(I)的 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類，其中

A 代表 O (氧)或 S (硫)，

Hal 代表氟、氯、溴或碘，

R 代表氫、C_1-C_6-烷基、C_1-C_4-烷基亞磺醯基、C_1-C_4-烷基磺醯基、C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基、C_3-C_6-環烷基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_4-鹵烷基、C_1-C_4-鹵烷基硫基、C_1-C_4-鹵烷基

亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基、C_3-C_8-鹵基環烷基；甲醯基、甲醯基-C_1-C_3-烷基、(C_1-C_3-烷基)羰基-C_1-C_3-烷基、(C_1-C_3-烷氧基)羰基-C_1-C_3-烷基；各具有 1 至 13 個氟、氯及/或溴原子之鹵基-(C_1-C_3-烷基)羰基-C_1-C_3-烷基、鹵基-(C_1-C_3-烷氧基)羰基-C_1-C_3-烷基；

(C_1-C_6-烷基)羰基、(C_1-C_4-烷氧基)羰基、(C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基)羰基、(C_3-C_6-環烷基)羰基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之(C_1-C_4-鹵烷基)羰基、(C_1-C_4-鹵基烷氧基)羰基、(鹵基-C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基)羰基、(C_3-C_6-鹵基環烷基)羰基；或-C(=O)C(=O)R^1、-CONR^{2}R^3 或-CH$_2$NR^{4}R^5，

R^1 代表氫、C_1-C_6-烷基、C_1-C_4-烷氧基、C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基、C_3-C_6-環烷基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_4-鹵烷基、C_1-C_4-鹵基烷氧基、鹵基-C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基、C_3-C_6-鹵基環烷基，

R^2 與 R^3 彼此獨立地代表氫、C_1-C_6-烷基、C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基、C_3-C_6-環烷基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_4-鹵烷基、鹵基-C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基、C_3-C_6-鹵基環烷基，

R^2 與 R^3 進一步和與其連接之氮原子一起代表具有 5 或 6 個環原子之飽和雜環，其視需要被得自包括鹵

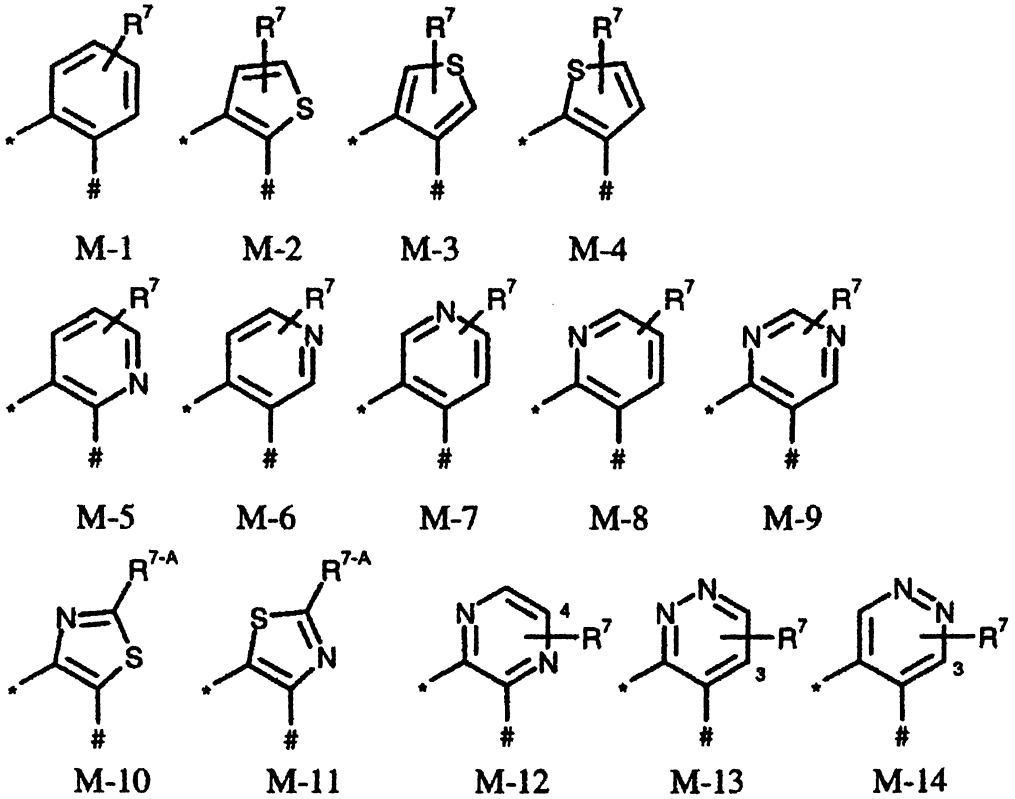
素與 C_1-C_4-烷基之組群之相同或不同取代基單至四取代，其中雜環可含有 1 或 2 個另外之得自包括氧、硫與 NR^6 之組群之不相鄰雜原子，

R^4 與 R^5 彼此獨立地代表氫、C_1-C_6-烷基、C_3-C_6-環烷基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_4-鹵烷基、C_3-C_6-鹵基環烷基，

R^4 與 R^5 進一步和與其連接之氮原子一起形成具有 5 或 6 個環原子之飽和雜環，其視需要被得自包括鹵素與 C_1-C_4-烷基之組群之相同或不同取代基單或多取代，其中雜環可含有 1 或 2 個另外之得自包括氧、硫與 NR^6 之組群之不相鄰雜原子，

R^6 代表氫或 C_1-C_4-烷基，

M 代表下文諸環之一者



其中標示「*」之鍵係連接於醯胺；標示「#」之鍵係連接於Z基團，

R^7 代表氫、氟、氯、甲基、異丙基、甲硫基或三氟甲基，

R^{7-A} 代表氫、甲基或三氟甲基，

Z 代表 Z^1、Z^2、Z^3 或 Z^4，其中

Z^1 代表苯基，其視需要被相同或不同取代基單-至五取代，取代基於各情形下係選自 W^1 所列舉者，

W^1 代表鹵素、氰基、硝基、胺基、羥基、甲醯基、羧基、胺甲醯基、硫代胺甲醯基；

各具有1至8個碳原子之各為直鏈或分支鏈之烷基、羥烷基、羰烷基、烷氧基、烷氧烷基、烷硫基烷基、二烷氧烷基、烷硫基、烷基亞磺醯基或烷基磺醯基；

各具有2至6個碳原子之各為直鏈或分支鏈之烯基或烯基氧基；

各具有1至6個碳原子及1至13個相同或不同鹵原子之各為直鏈或分支鏈之鹵烷基、鹵基烷氧基、鹵基烷硫基、鹵烷基亞磺醯基或鹵烷基磺醯基；

各具有2至6個碳原子及1至11個相同或不同鹵原子之各為直鏈或分支鏈之鹵烯基或鹵基烯氧基；

於各個烴鏈具有1至6個碳原子之各為直鏈或分

支鏈之烷胺基、二烷胺基、烷羰基、烷羰基氧基、烷氧羰基、烷胺基羰基、二烷胺基羰基、芳烷胺基羰基、二烷胺基羰氧基，於各個烴鏈具有2至6個碳原子之烯羰基或炔羰基；

各具有3至6個碳原子之環烷基或環烷基氧基；具有3或4個碳原子之雙連接之伸烷基、具有2或3個碳原子之氧基伸烷基或具有1或2個碳原子之二氧基伸烷基，各者視需要被得自包括氟、氯、酮基、甲基、三氟甲基與乙基之組群之相同或不同取代基單至四取代；

或$-C(Q^1)=N-Q^2$基團，其中

Q^1　代表氫、羥基或具有1至4個碳原子之烷基、具有1至4個碳原子及1至9個氟、氯及/或溴原子之鹵烷基或具有1至6個碳原子之環烷基及

Q^2　代表羥基、胺基、甲胺基、苯基、苄基或代表具有1至4個碳原子之於各情形下視需要被氰基-、羥基-、烷氧基-、烷硫基-、烷胺基-、二烷胺基-或苯基-取代之具有1至4個碳原子之烷基或烷氧基，或代表各具有2至4個碳原子之烯氧基或炔氧基，

以及苯基、苯氧基、苯硫基、苯甲醯基、苯甲醯基乙烯基、肉桂醯基、雜環基或苯基烷基、苯基烷氧基、苯基烷硫基、或雜環烷基，彼等於各個

烷基鏈各具有 1 至 3 個碳原子，及各者於環部分視需要被鹵素及/或具有 1 至 4 個碳原子之直鏈或分支鏈烷基或烷氧基單-至三取代，

Z^2 代表各具有 3 至 10 個碳原子之環烷基或雙環烷基，各者視需要被得自包括鹵素與 C_1-C_4-烷基之組群之相同或不同取代基單-至四取代，

Z^3 代表未經取代之 C_2-C_{20}-烷基或代表 C_1-C_{20}-烷基，其被得自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：氟、氯、溴、碘、C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷氧基、C_1-C_6-烷胺基、二(C_1-C_6-烷基)胺基、C_1-C_6-鹵基烷硫基、C_1-C_6-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_6-鹵烷基磺醯基、C_1-C_6-鹵基烷氧基、C_1-C_6-鹵基烷胺基、鹵基-二(C_1-C_6-烷基)胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$ 與 C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被得自包括氟、氯、溴、碘、C_1-C_4-烷基與 C_1-C_4-鹵烷基之組群之相同或不同取代基單-至四取代，

Z^4 代表 C_2-C_{20}-烯基或 C_2-C_{20}-炔基，各者視需要被得自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：氟、氯、溴、碘、C_1-C_6-烷硫基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_6-烷氧基、C_1-C_6-烷胺基、二(C_1-C_6-烷基)胺基、C_1-C_6-鹵基烷硫基、C_1-C_6-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_6-鹵烷基磺醯基、C_1-C_6-鹵基烷氧基、C_1-C_6-鹵基烷胺基、鹵基

-二(C_1-C_6-烷基)胺基、-$SiR^8R^9R^{10}$ 與 C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被得自包括氟、氯、溴、碘、C_1-C_4-烷基與 C_1-C_4-鹵烷基之組群之相同或不同取代基單-至四取代，

R^8 與 R^9 彼此獨立地代表 C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基或 C_1-C_3-烷硫基-C_1-C_3-烷基，

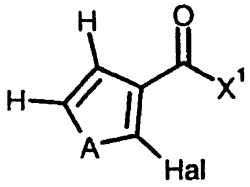
R^{10} 代表 C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷氧基、C_1-C_3-烷氧基-C_1-C_3-烷基、C_1-C_3-烷硫基-C_1-C_3-烷基、C_3-C_6-環烷基、苯基或苄基，

或

M與Z一起代表1,1,3-三甲基-1H-2,3-二氫茚-4-基、1,3-二甲基-1H-2,3-二氫茚-4-基、1,1,3-三甲基-1,3-二氫-2-苯並呋喃-4-基、1,3-二甲基-1,3-二氫-2-苯並呋喃-4-基、1,1,3-三甲基-1,3-二氫-2-苯並噻吩-4-基或1,3-二甲基-1,3-二氫-2-苯並噻吩-4-基。

3. 一種製備根據申請專利範圍第1項之式(I)的2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類之方法，其特徵為

a) 使式(II)之羧酸衍生物



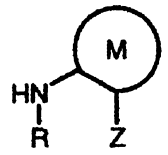
(II)

式中

A與Hal如申請專利範圍第1項中之界定及

X^1　代表鹵素或羥基

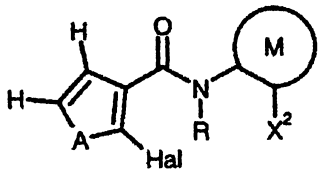
適當時於觸媒存在下、適當時於縮合劑存在下、適當時於酸結合劑存在下及適當時於稀釋劑存在下，與式(III)之苯胺衍生物反應



(III)

，或

b) 使式(IV)之鹵基羧醯胺類



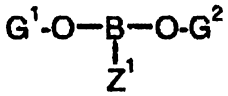
(IV)

式中

A、Hal、R 與 M 如申請專利範圍第 1 項中之界定，

X^2　代表溴、碘或三氟甲基磺酸根，

於觸媒存在下、適當時於酸結合劑存在下及適當時於稀釋劑存在下，與式(V)之硼酸衍生物反應



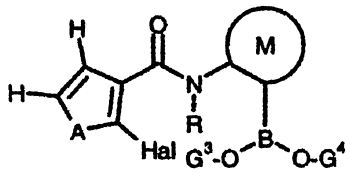
(V)

式中

Z^1　如申請專利範圍第 1 項中之界定及

G^1 與 G^2 各代表氫或一起代表四甲基伸乙基，或

c) 使式(VI)之硼酸衍生物



(VI)

式中

A、Hal、R與M如申請專利範圍第1項中之界定，

G^3與G^4各代表氫或一起代表四甲基伸乙基，

適當時於觸媒存在下、適當時於酸結合劑存在下及適當時於稀釋劑存在下，與式(VII)之苯基衍生物反應

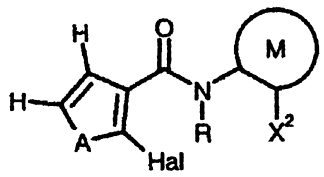
$X^3—Z^1$ (VII)

式中

Z^1 如申請專利範圍第1項中之界定及

X^3 代表溴、碘或三氟甲基磺酸根，或

d) 使式(IV)之鹵基羧醯胺類



(IV)

式中

A、Hal、R與M如申請專利範圍第1項中之界定，

X^2 代表溴、碘或三氟甲基磺酸根，

於鈀或鎳觸媒存在下及於 4,4,4',4',5,5,5',5'-八甲基-2,2'-雙-1,3,2-二𠰌硼茂烷存在下、適當時於酸結合劑存在下及適當時於稀釋劑存在下，與式(VII)之苯基衍生物反應

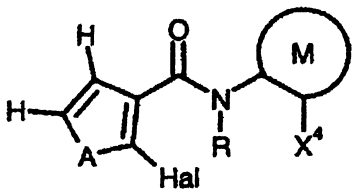
$X^3—Z^1$ (VII)

式中

Z^1 如申請專利範圍第 1 項中之界定及

X^3 代表溴、碘或三氟甲基磺酸根，或

e) 使式(I-a)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類適當時於稀釋劑存在下及適當時於觸媒存在下進行氫化反應



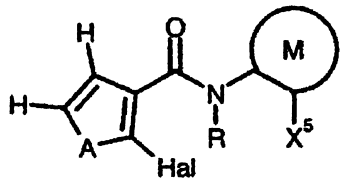
(I-a)

式中

A、Hal、R 與 M 如申請專利範圍第 1 項中之界定，

X^4 代表 C_2-C_{20}-烯基或 C_2-C_{20}-炔基，各者視需要被選自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：鹵素、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、鹵烷基硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基、鹵基二烷胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$ 及/或 C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或 C_1-C_4-烷基取代，或

f) 使式(VIII)之羥烷基羧醯胺類適當時於稀釋劑存在下及適當時於酸存在下進行脫水反應



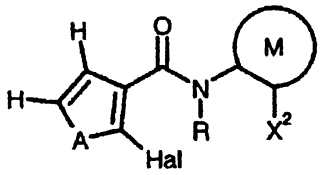
(VIII)

式中

A、Hal、R與M如申請專利範圍第1項中之界定，

X^5 代表 C_2-C_{20}-羥烷基，其視需要附加地被選自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：鹵素、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、鹵烷基硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基、鹵基二烷胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$與 C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或 C_1-C_4-烷基取代，或

g) 使式(IV)之鹵基羧醯胺類



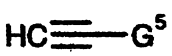
(IV)

式中

A、Hal、R與M如申請專利範圍第1項中之界定，

X^2 代表溴、碘或三氟甲基磺酸根，

與式(IX)之炔

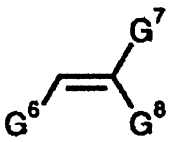


(IX)

式中

G^5 代表 C_2-C_{18}-烷基，其視需要被選自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：鹵素、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、鹵烷基硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基、鹵基二烷胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$ 與 C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或 C_1-C_4-烷基取代，

或與式(X)之烯烴適當時於稀釋劑存在下、適當時於酸結合劑存在下及適當時於一或多種觸媒存在下進行反應



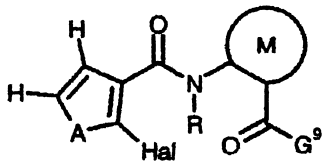
(X)

式中

G^6、G^7 與 G^8 彼此獨立地各自代表氫或烷基，其視需要被選自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：鹵素、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、鹵烷基硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基、鹵基二烷胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$ 與 C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或 C_1-C_4-烷基取代及開鏈分子部分(不含取代基)之碳原子總數不

超過 20 個，或

h) 使式(XI)之酮類



(XI)

式中

A、Hal、R 與 M 如申請專利範圍第 1 項中之界定，

G^9 代表氫或 C_1-C_{18}-烷基，其視需要被選自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：鹵素、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、鹵烷基硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基、鹵基二烷胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$ 與 C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或 C_1-C_4-烷基取代，

適當時於稀釋劑存在下，與式(XII)之磷化合物反應

$G^{10}—Px$ (XII)

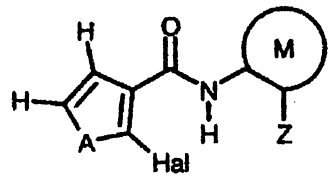
式中

G^{10} 代表 C_1-C_{18}-烷基，其視需要被選自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：鹵素、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、鹵烷基硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基、

鹵基二烷胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$ 及/或 C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或 C_1-C_4-烷基取代，

Px 代表 $-P^+(C_6H_5)_3Cl^-$、$-P^+(C_6H_5)_3Br^-$、$-P^+(C_6H_5)_3I^-$、$-P(=O)(OCH_3)_3$ 或 $-P(=O)(OC_2H_5)_3$ 等基團，或

i) 使式(I-b)之 2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類



(I-b)

式中

A、Hal、R、M 與 Z 如申請專利範圍第 1 項中之界定，

於鹼存在下及於稀釋劑存在下，與式(XIII)之鹵化物反應

$R^a—X^6$ (XIII)

式中

R^a 代表 C_1-C_8-烷基、C_1-C_6-烷基亞磺醯基、C_1-C_6-烷基磺醯基、C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_3-C_8-環烷基；各具有 1 至 9 個氟、氯及/或溴原子之 C_1-C_6-鹵烷基、C_1-C_4-鹵烷基硫基、C_1-C_4-鹵烷基亞磺醯基、C_1-C_4-鹵烷基磺醯基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基、C_3-C_8-鹵基環烷基；甲醯基、甲醯基-C_1-C_3-烷基、

(C_1-C_3-烷基)羰基-C_1-C_3-烷基、(C_1-C_3-烷氧基)羰基-C_1-C_3-烷基；各具有1至13個氟、氯及/或溴原子之鹵基-(C_1-C_3-烷基)羰基-C_1-C_3-烷基、鹵基-(C_1-C_3-烷氧基)羰基-C_1-C_3-烷基；(C_1-C_8-烷基)羰基、(C_1-C_8-烷氧基)羰基、(C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基)羰基、(C_3-C_8-環烷基)羰基；各具有1至9個氟、氯及/或溴原子之(C_1-C_6-鹵烷基)羰基、(C_1-C_6-鹵基烷氧基)羰基、(鹵基-C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基)羰基、(C_3-C_8-鹵基環烷基)羰基；或-C(=O)C(=O)R^1、-CONR^{2}R^{3}或-CH_2NR^{4}R^5，

R^1、R^2、R^3、R^4與R^5如申請專利範圍第1項中之界定，

X^6　代表氯、溴或碘。

4. 一種用於防治有害微生物之組成物，其特徵為除了增充劑及/或界面活性劑外，尚包含至少一種根據申請專利範圍第1項之式(I)的2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺。

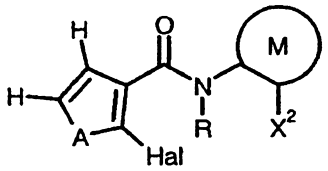
5. 一種使用根據申請專利範圍第1項之式(I)的2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類以防治有害微生物之用途。

6. 一種防治有害微生物之方法，其特徵為將根據申請專利範圍第1項之式(I)的2-鹵基呋喃基/噻吩基-3-羧醯胺類施加於彼等微生物及/或其棲息處。

7. 一種製備用於防治有害微生物的組成物之方法，其特徵為使根據申請專利範圍第1項之式(I)的2-鹵基呋喃基/

噻吩基-3-羧醯胺類與增充劑及/或界面活性劑混合。

8. 一種具式(IV)之鹵基羧醯胺類



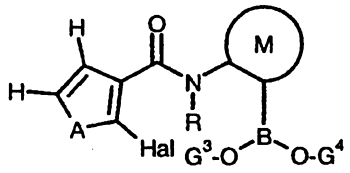
(IV)

式中

A、Hal、R與M如申請專利範圍第1項中之界定，

X^2 代表溴或碘。

9. 一種具式(VI)之硼酸衍生物



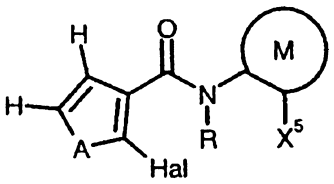
(VI)

式中

A、Hal、R與M如申請專利範圍第1項中之界定，

G^3與G^4各代表氫或一起代表四甲基伸乙基。

10. 一種具式(VIII)之羥烷基羧醯胺類



(VIII)

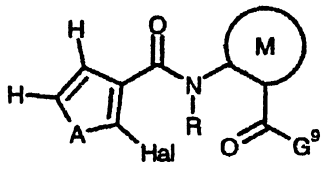
式中

A、Hal、R與M如申請專利範圍第1項中之界定，

X^5 代表 C_2-C_{20}-羥烷基，其視需要附加地被選自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：鹵素、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、

二烷胺基、鹵烷基硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基、鹵基二烷胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$與C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或C_1-C_4-烷基取代。

11.一種具式(XI)之酮類



(XI)

式中

A、Hal、R與M如申請專利範圍第1項中之界定，

G^9 代表氫或C_1-C_{18}-烷基，其視需要被選自下述組群之相同或不同取代基單或多取代：鹵素、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、鹵烷基硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、鹵基烷氧基、鹵基烷胺基、鹵基二烷胺基、$-SiR^8R^9R^{10}$與C_3-C_6-環烷基，其中環烷基基團部分可視需要被鹵素及/或C_1-C_4-烷基取代。

七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第（　　）圖。　無

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

無

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

無