(19)中華民國智慧財產局
(12)發明說明書公開本 (11)公開編號：TW 201002204 A1
(43)公開日： 中華民國 99 (2010) 年 01 月 16 日

(21)申請案號：098121940 (22)申請日： 中華民國 98 (2009) 年 06 月 30 日
(51)Int. Cl.： *A01N43/56 (2006.01)* *C07D413/04 (2006.01)*
C07D231/14 (2006.01) *A01P3/00 (2006.01)*
(30)優先權：2008/07/01 英國 0812028.9
(71)申請人：先正達合夥公司 (瑞士) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (CH)
瑞士
(72)發明人：赫斯 烏瑞琪 瓊安娜 HAAS, ULRICH JOHANNES (DE) ；華特 哈瑞德 WALTER, HARALD (DE) ；司堤爾里 丹尼爾 STIERLI, DANIEL (CH)
(74)代理人：桂齊恆；閻啟泰
申請實體審查：無 申請專利範圍項數：12 項 圖式數：0 共 80 頁

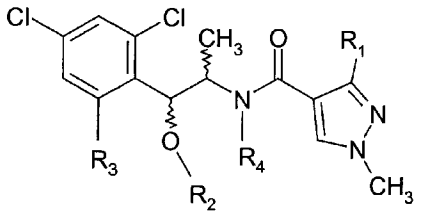
(54)名稱

殺真菌組成物

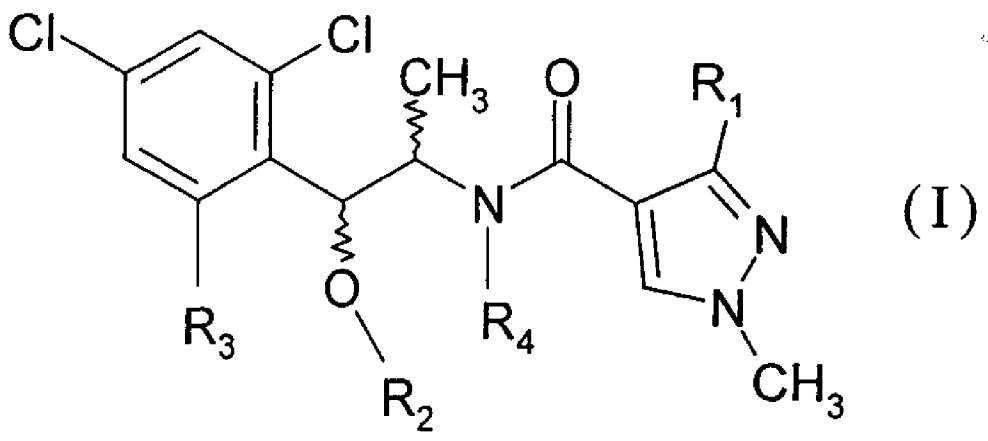
FUNGICIDAL COMPOSITIONS

(57)摘要

一種控制有用植物或其繁殖物質上的植物病原性(phytopathogenic)疾病之方法，其包含將增效有效量的成分 A)和 B)之組合物施用至有用植物、其所在地或其繁殖物質，其中成分 A)為一種式 I 的化合物


(I)，

其中 R_1 為 CF_2H 或 CF_3；R_2 為甲基或乙基；R_3 為氫或氯；及 R_4 為氫或環丙基；及該等化合物之農藝上可接受的鹽類/異構物/鏡像異構物/互變異構物/N-氧化物；及成分 B)為一種選自已知其殺真菌及/或殺蟲活性之化合物的化合物，在控制或預防有用植物之真菌疾病是特別地有效的。


(I)

(19)中華民國智慧財產局
(12)發明說明書公開本 (11)公開編號：TW 201002204 A1
(43)公開日： 中華民國 99 (2010) 年 01 月 16 日

(21)申請案號：098121940 (22)申請日： 中華民國 98 (2009) 年 06 月 30 日
(51)Int. Cl.： *A01N43/56 (2006.01)* *C07D413/04 (2006.01)*
C07D231/14 (2006.01) *A01P3/00 (2006.01)*
(30)優先權：2008/07/01 英國 0812028.9
(71)申請人：先正達合夥公司 (瑞士) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (CH)
瑞士
(72)發明人：赫斯 烏瑞琪 瓊安娜 HAAS, ULRICH JOHANNES (DE) ；華特 哈瑞德 WALTER, HARALD (DE) ；司堤爾里 丹尼爾 STIERLI, DANIEL (CH)
(74)代理人：桂齊恆；閻啟泰
申請實體審查：無 申請專利範圍項數：12 項 圖式數：0 共 80 頁

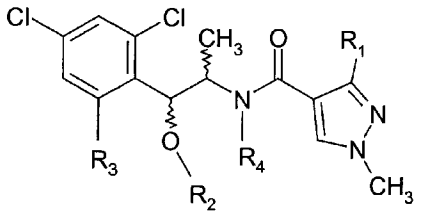
(54)名稱

殺真菌組成物

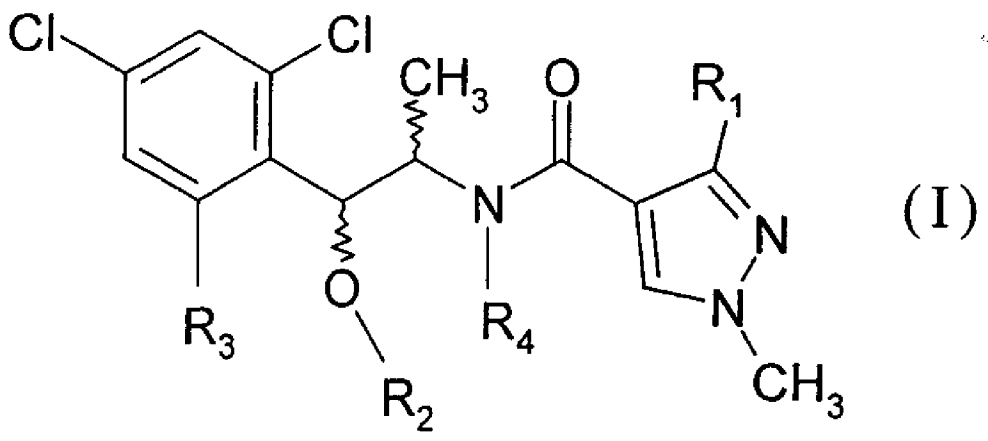
FUNGICIDAL COMPOSITIONS

(57)摘要

一種控制有用植物或其繁殖物質上的植物病原性(phytopathogenic)疾病之方法，其包含將增效有效量的成分 A)和 B)之組合物施用至有用植物、其所在地或其繁殖物質，其中成分 A)為一種式 I 的化合物


(I)，

其中 R_1 為 CF_2H 或 CF_3；R_2 為甲基或乙基；R_3 為氫或氯；及 R_4 為氫或環丙基；及該等化合物之農藝上可接受的鹽類/異構物/鏡像異構物/互變異構物/N-氧化物；及成分 B)為一種選自已知其殺真菌及/或殺蟲活性之化合物的化合物，在控制或預防有用植物之真菌疾病是特別地有效的。


(I)

六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

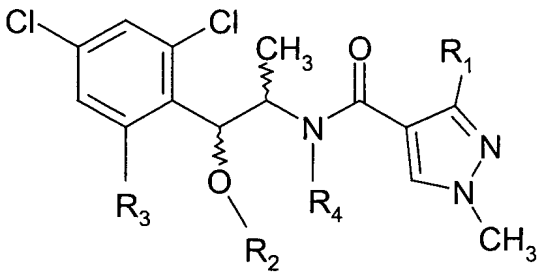
本發明係有關用於治療有用植物之植物病原性(phytopathogenic)疾病，特別是植物病原性真菌的新穎殺真菌組成物、及有關一種控制有用植物的植物病原性疾病之方法。

【先前技術】

從 WO 2007/141009 和 WO 2007/060164 已知某些 N-[2-(苯基)乙基]-甲醯胺衍生物具有對抗植物病原性真菌的生物活性。另一方面已廣泛地知道不同化學種類之各種殺真菌化合物應用在各種栽培植物之作物中作為植物殺真菌劑。然而，在許多事件和觀點中，作物耐受性和對抗植物病原性植物真菌之活性總是不符合農業實務之需求。

【發明內容】

因此根據本發明提出一種控制有用植物或其繁殖物質上的植物病原性疾病之方法，其包含將增效有效量的成分 A)和 B)之組合物施用至有用植物、其所在地或其繁殖物質，其中成分 A)為一種式 I 的化合物



(I)，

其中

R_1 為 CF_2H 或 CF_3；

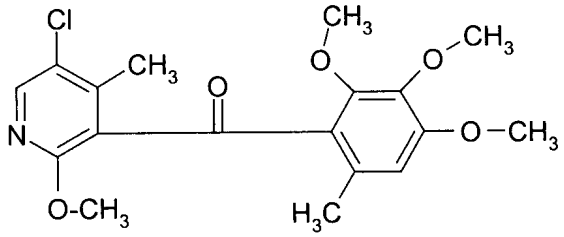
R_2 為甲基或乙基；

R_3 為氫或氟；及

R_4 為氫或環丙基；

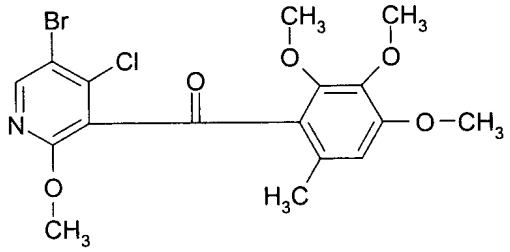
及該等化合物之農藝上可接受的鹽類/異構物/鏡像異構物/互變異構物/N-氧化物；及成分 B)為一種選自由下列所組成群組之化合物：亞托敏(azoxystrobin)、啶氧菌酯(picoxystrobin)、環克座(cyproconazole)、待克利(difenoconazole)、普克利(propiconazole)、護汰寧(fludioxonil)、賽普洛(cyprodinil)、芬必莫(fenpropimorph)、芬撲定(fenpropidin)、依普座(epoxiconazole)、依康唑(ipconazole)、雙炔醯菌胺(mandipropamid)、四氯異苯腈(chlorothalonil)、吲唑磺菌胺(amisulbrom)、比沙吩(bixafen)、白克列(boscalid)、賽福滅(cyflufenamid)、待莫賓(dimoxystrobin)、烯肟菌酯(enestrobin)、噻唑菌胺(ethaboxam)、氟吡菌胺(fluopicolide)、氟吡菌醯胺(fluopyram)、氟沙賓(fluoxastrobin)、氟噻腈(fluthianil)、依康唑(ipconazole)、異噻菌胺(isotianil)、美芬酮(metrafenone)、肟醚菌胺(orysastrobin)、吡噻菌胺(penthiopyrad)、丙氧喹啉(proquinazid)、丙硫菌唑(prothioconazole)、百克敏(pyraclostrobin)、必立貝卡(pyribencarb)、瓦利非那(valiphenal)、異吡劄(isopyrazam)、1-甲基-環丙烯、平克座(penconazole)、得克利

(tebuconazole)、三氟敏(trifloxystrobin)、硫、碳酸銅銨、油酸銅、福爾培(folpet)、奎諾斯芬(quinoxyfen)、鋅錳乃浦(mancozeb)、蓋普丹(captan)、芬海米(fenhexamid)、甲霜靈(mefenoxam)、腈硫醌(dithianon)、阿昔貝拉(acibenzolar)、固殺草(glufosinate)及其鹽類、嘉磷塞(glyphosate)及其鹽類、一種式 II 之化合物



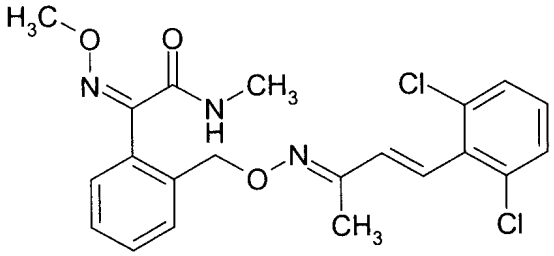
(II)，

一種式 III 之化合物



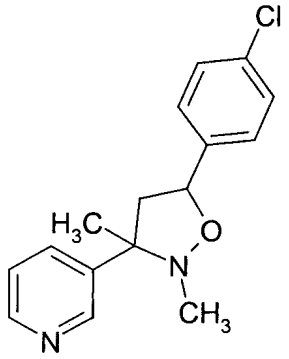
(III)，

一種式 IV 之化合物



(IV)，

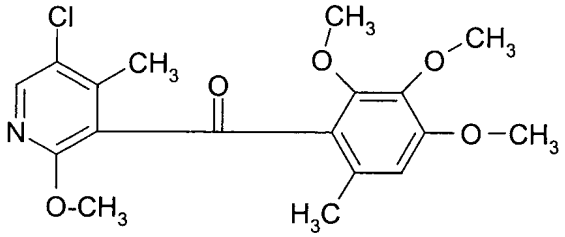
及一種式 V 之化合物



(V)

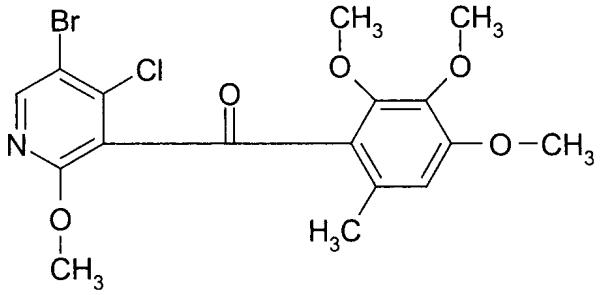
。

較佳地本發明係有關一種控制有用植物或其繁殖物質上的植物病原性疾病之方法，其包含將增效有效量的成分A)和 B)之組合物施用至有用植物、其所在地或其繁殖物質，其中成分 A)為一種如上所述之式 I 化合物，及成分 B)為一種選自由下列所組成群組之化合物：亞托敏、啶氧菌酯、環克座、待克利、普克利、護汰寧、賽普洛、芬必莫、芬撲定、依普座、依康唑、雙炔醯菌胺、四氯異苯腈、吲唑磺菌胺、比沙吩、白克列、賽福滅、待莫賓、烯肟菌酯、噻唑菌胺、氟吡菌胺、氟吡菌醯胺、氟沙賓、氟噻腈、依康唑、異噻菌胺、美芬酮、肟醚菌胺、吡噻菌胺、丙氧喹啉、丙硫菌唑、百克敏、必立貝卡、瓦利非那、一種式 II 之化合物



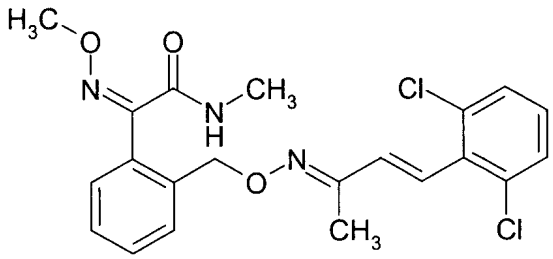
(II) ，

一種式 III 之化合物



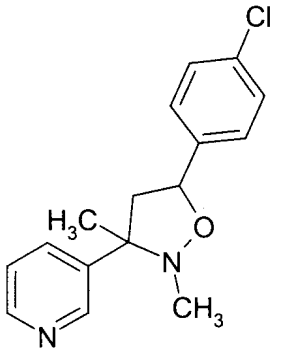
(III)，

一種式 IV 之化合物



(IV)，

及一種式 V 之化合物



(V)

。

【實施方式】

現已驚人地發現根據本發明的活性成分混合物不僅提供有關額外增強關於原則上期待被控制之植物病原性的作用範圍，並也達成增效作用，其以兩種方式延伸成分(A)及成分(B)之作用範圍。第一，降低成分(A)及成分(B)的施用率，同時維持同樣好的作用。第二，活性成分混合物仍達

成高度的植物病原控制，甚至在兩種個別成分在這樣低的施用率範圍下變成完全無效時。其一方面允許實質上拓寬可被控制之植物病原的範圍，另一方面增加使用時的安全性。

然而，除了關於殺真菌活性之實際的增效作用之外，根據本發明的殺有害生物組成物也具有更驚人的有利性質，以廣義而言，其也被說明成增效活性。該等可述及之有利性質的例子為：對其它的植物病原性(例如對抗藥性菌株)之殺真菌活性變寬；減低活性成分之施用率；對抗動物有害生物(例如昆蟲或蜱蟎目代表)之增效活性；拓寬對其它動物有害生物(例如抗藥性動物有害生物)之殺有害生物活性範圍；在根據本發明的組成物輔助下適當的有害生物控制，甚至在個別化合物為成完全無效之施用率；在調配期間及/或施用時(例如在研磨、過篩、乳化、溶解或分散時)的有利特性；增加貯存穩定性；改進對光的穩定性；更有利的降解性；改進毒物學及/或生態毒物學特性；改進有用植物的特性，包括萌芽、作物產量、更發達的根系統、分蘖數增加、增加植物高度、葉片較大、枯死的基部葉片較少、更旺盛的分蘖、更綠的葉片色彩、需求的肥料更少、需求的種子更少、更多的有效分蘖、更早開花、更早的穀物成熟度、更少的植物逆轉(倒伏)、增加芽生長、改進植物活力和早期發芽；或熟諳此技藝者熟悉的任何其它優點。

式 I 之化合物及其製造方法係描述於例如 PCT/EP2008/004547 中。

化合物 B 為已知的且以 CAS-註冊號註冊 http：//www/：亞托敏(131860-33-8)、啶氧菌酯(117428-22-5)、環克座(94361-06-5)、待克利(119446-68-3)、普克利(60207-90-1)、護汰寧(131341-86-1)、賽普洛(121552-61-2)、芬必莫(67564-91-4)、芬撲定(67306-00-7)、依普座(133855-98-8)、依康唑(125225-28-7)、雙炔醯菌胺(374726-62-2)、四氯異苯腈(1897-45-6)、吲唑磺菌胺(348635-87-0)、比沙吩(581809-46-3)、白克列(188425-85-6)、賽福滅(180409-60-3)、待莫賓(149961-52-4)、烯肟菌酯(238410-11-2)、噻唑菌胺(16650-77-3)、氟吡菌胺(239110-15-7)、氟吡菌醯胺(658066-35-4)、氟沙賓(193740-76-0)、氟噻腈(304900-25-2)、依康唑(125225-28-7)、異噻菌胺(224049-04-1、美芬酮(220899-03-6)、肟醚菌胺(248593-16-0)、吡噻菌胺(183675-82-3)、丙氧喹啉(189278-12-4)、丙硫菌唑(178928-70-6)、百克敏(175013-18-0)、必立貝卡(325156-49-8)、瓦利非那、(283159-90-0)、式 II 之化合物(688046-61-9)、式 III 之化合物(688046-51-7)、式 IV 之化合物(366815-39-6)、式 V 之化合物(291771-99-8)、1-甲基-環丙烯(3100-04-7)、平克座(66246-88-6)、平克座(107534-96-3)、三氟敏(141517-21-7)、硫(7704-34-9)、碳酸銅銨(CAS 33113-08-5)；油酸銅(CAS 1120-44-1)；福爾培(133-07-3)、奎諾斯芬(124495-18-7)、鋅錳乃浦(8018-01-7)、蓋普丹(133-06-2)、芬海米

(126833-17-8)、芬海米(70630-17-0)、腈硫醌(3347-22-6)、阿昔貝拉(126448-41-7)、固殺草及其鹽類(51276-47-2、35597-44-5(S-異構物))、嘉磷塞(1071-83-6)及其鹽類(69254-40-6(二銨)、34494-04-7(二甲銨)、38641-94-0(異丙銨)、40465-66-5(單銨)、70901-20-1(鉀)、70393-85-0(倍半鈉鹽)、81591-81-3(三甲基硫鹽(trimesium))。異吡劄係揭示於 W02004/035589 中。異吡劄為一種 2 種同側異構物 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(1RS,4SR,9RS)-1,2,3,4-四氫-9-異丙基-1,4-亞甲基萘-5-基]吡唑-4-甲醯胺和 2 種反側異構物 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(1RS,4SR,9SR)-1,2,3,4-四氫-9-異丙基-1,4-亞甲基萘-5-基]吡唑-4-甲醯胺之混合物且以 CA 號 683777-13-1 和 683777-14-2 註冊。

根據本發明，嘉磷塞之較佳鹽類為為鉀、異丙銨、鈉、三甲基硫鹽、銨及二銨鹽類。固殺草之較佳鹽類係揭示於 US-A-4,168,963 中，較佳鹽為銨鹽。

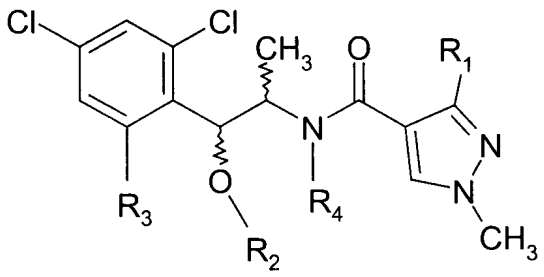
根據本發明，"消旋化合物"表示一種於實質上 50：50 的比之至少二種鏡像異構物的混合物。

式 I 之化合物包含 4 種立體異構形式(2 種非鏡像異構物且各非鏡像異構物包含 2 種鏡像異構物)，具有 2；1 之比的二種反側形式對二種同側形式。

例如，如果希望拓寬植物病原性疾病控制之範圍時，則根據本發明的組合物也可包含一種以上的活性成分 B)。例如，在農業實務中，組合二或三種之成分 B)與任何的式 I 化合物，或與任何的式 I 化合物群組之較佳成員是有利的。

較佳化合物 A)係列於下表 1 中：

表 1：式 I 之化合物



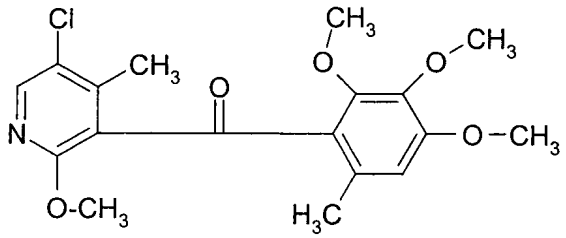
(I)，

化合物編號	R_1	R_2	R_3	R_4
1.001	CF_2H	CH_3	H	H
1.002	CF_3	CH_3	H	H
1.003	CF_2H	C_2H_5	H	H
1.004	CF_3	C_2H_5	H	H
1.005	CF_2H	CH_3	Cl	H
1.006	CF_3	CH_3	Cl	H
1.007	CF_2H	C_2H_5	Cl	H
1.008	CF_3	C_2H_5	Cl	H
1.009	CF_2H	CH_3	H	環丙基
1.010	CF_3	CH_3	H	環丙基
1.011	CF_2H	C_2H_5	H	環丙基
1.012	CF_3	C_2H_5	H	環丙基
1.013	CF_2H	CH_3	Cl	環丙基
1.014	CF_3	CH_3	Cl	環丙基
1.015	CF_2H	C_2H_5	Cl	環丙基
1.016	CF_3	C_2H_5	Cl	環丙基

下列成分 A)與成分 B)之混合物為較佳(縮寫"TX"表示："一選自由明確地描述在本發明之表 1 中的化合物所組成群組之化合物")：

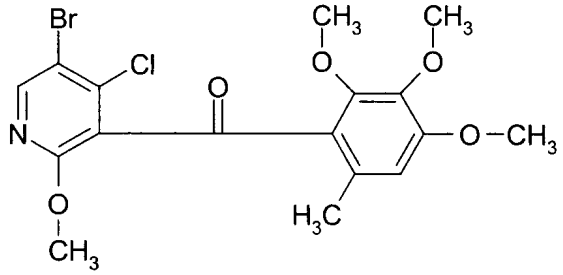
亞托敏+TX、啶氧菌酯+TX、環克座+TX、待克利+TX、普克利+TX、護汰寧+TX、賽普洛+TX、芬必莫+TX、芬撲定+TX、依普座+TX、依康唑+TX、雙炔醯菌胺+TX、四氯異苯腈+TX、吲唑磺菌胺+TX、比沙吩+TX、白克列+TX、賽福滅+TX、待莫賓+TX、烯肟菌酯+TX、噻唑菌胺+TX、氟吡菌胺+TX、氟吡菌醯胺+TX、氟沙賓+TX、氟噻腈+TX、依康唑+TX、異噻菌胺+TX、美芬酮+TX、肟醚菌胺+TX、吡噻菌胺+TX、丙氧喹啉+TX、丙硫菌唑+TX、百克敏+TX、必立貝卡+TX、瓦利非那、+TX、異吡劑+TX、1-甲基-環丙烯+TX、平克座+TX、平克座+TX、三氟敏+TX、硫+TX、碳酸銅銨+TX、油酸銅+TX、福爾培+TX、奎諾斯芬+TX、鋅錳乃浦+TX、蓋普丹+TX、芬海米+TX、芬海米+TX、腈硫醌+TX、阿昔貝拉+TX、固殺草及其鹽類+TX、嘉磷塞及其鹽類+TX、

一種式 II 之化合物



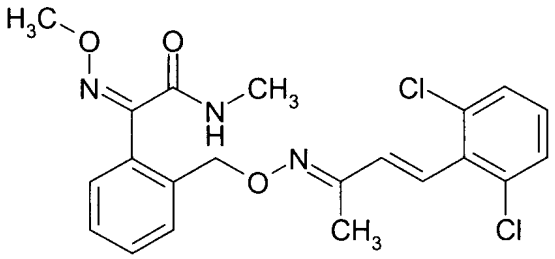
(II) + TX ，

一種式 III 之化合物



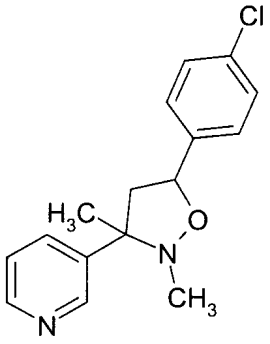
(III) + TX ，

一種式 IV 之化合物



(IV) + TX ，

及一種式 V 之化合物

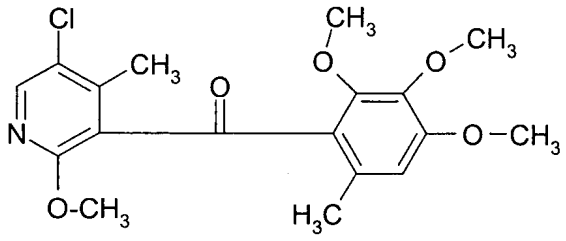


(V) + TX

。

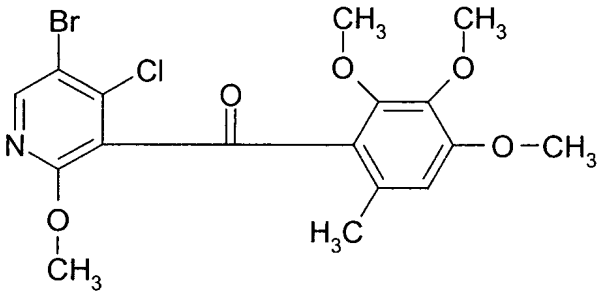
成分 A)與成分 B)之特佳混合物為亞托敏+TX、啶氧菌酯+TX、環克座+TX、待克利+TX、普克利+TX、護汰寧+TX、賽普洛+TX、芬必莫+TX、芬撲定+TX、依普座+TX、依康唑+TX、雙炔醯菌胺+TX、四氯異苯腈+TX、吲唑磺菌胺+TX、比沙吩+TX、白克列+TX、賽福滅+TX、待莫賓+TX、烯肟菌酯+TX、噻唑菌胺+TX、氟吡菌胺+TX、氟吡菌醯胺+TX、氟沙賓+TX、氟噻腈+TX、依康唑+TX、異噻菌胺+TX、

美芬酮+TX、肟醚菌胺+TX、吡噻菌胺+TX、丙氧喹啉+TX、丙硫菌唑+TX、百克敏+TX、必立貝卡+TX、瓦利非那、+TX、一種式 II 之化合物



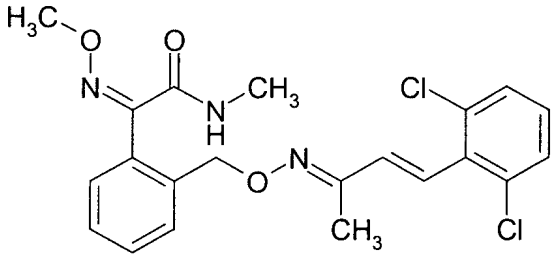
(II) + TX ，

一種式 III 之化合物



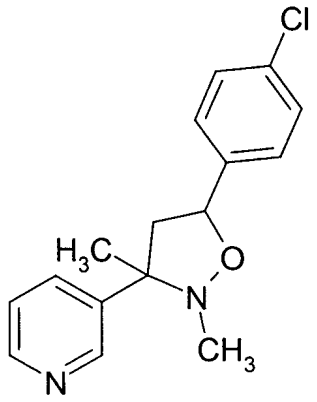
(III) + TX ，

一種式 IV 之化合物及



(IV) + TX ，

一種式 V 之化合物



(V) + TX

。

活性成分組合物有效對抗有害的微生物，例如引起植物病原性疾病之微生物，特別是對抗植物病原性真菌和細菌。

活性成分組合物對抗屬於下列各綱的植物病原性真菌特別有效：子囊菌綱(Ascomycetes)(例如蘋果黑星病菌屬(Venturia)、蘋果白澀病菌屬(Podosphaera)、白粉病菌屬(Erysiphe)、鏈核盤菌屬(Monilinia)、草莓斑葉病菌屬(Mycosphaerella)、葡萄白澀病菌屬(Uncinula)；擔子菌綱(Basidiomycetes)(例如鏽病菌屬(Hemileia)、馬鈴薯黑痣病菌屬(Rhizoctonia)、銹病菌屬(Puccinia)、黑穗病菌屬(Ustilago)、腥黑穗病菌屬(Tilletia)；不完全菌綱(Fungiimperfecti)(也已知為半知菌綱(Deuteromycetes)；例如灰黴屬(Botrytis)、長蠕孢菌屬(Helminthosporium)、啄孢菌屬(Rhynchosporium)、鐮菌屬(Fusarium)、殼針孢屬(Septoria)、菸菜斑點病菌屬(Cercospora)、馬鈴薯葉燒病菌屬(Alternaria)、梨胞黴屬(Pyricularia)和小麥基腐病菌(Pseudocercosporella herpotrichoides))；卵菌綱(Oomycetes)

(例如疫(病)菌(Phytophthora)、葛蔓露菌病菌屬(Peronospora)、假霜黴屬(Pseudoperonospora)、白銹菌屬(Albugo)、萵苣露菌病菌屬(Bremia)、腐黴菌屬(Pythium)、假指根黴菌(Pseudosclerospora)、單軸黴菌屬(Plasmopara))。

根據本發明，“有用植物”典型係包含下列的植物種類：葡萄藤；穀類(例如小麥、大麥、稞麥或燕麥)、甜菜(如糖甜菜或飼料甜菜)；果實(例如仁果類、核果類或漿果類，例如蘋果、梨子、梅子、桃子、杏仁、櫻桃、草莓、覆盆子或黑莓)；豆科植物(例如豆子、扁豆、碗豆或大豆)；油料植物(例如油菜、芥末、罌粟、橄欖、向日葵、椰子、蓖麻油植物、可可豆或落花生)；黃瓜科植物(例如葫蘆、黃瓜或甜瓜)；纖維植物(如棉、亞麻、大麻或黃麻)；柑桔類果實(如橘子、檸檬、葡萄柚或柑橘)；蔬菜類(例如菠菜、萵苣、蘆筍、包心菜、胡蘿蔔、洋蔥、蕃茄、馬鈴薯、葫蘆或甜椒)；樟類(例如酪梨、肉桂或樟腦)；玉米；煙草；堅果；咖啡；甘蔗；茶；葡萄樹；蛇麻草；榴槤果；香焦；天然橡膠植物；草坪或觀賞植物(例如花朵、灌木、闊葉樹或常綠植物，例如松柏)。此名單不代表任何限制。

術語“有用植物”應了解為也包括由於習知的繁殖或基因工程方法而對除草劑像是溴苯腈(bromoxynil)或除草劑類別(諸如，例如HPPD抑制劑、ALS抑制劑(例如氟嘧磺隆(primisulfuron)、三氟丙磺隆(prosulfuron)和三氟啶磺隆(trifloxysulfuron))、EPSPS(5-烯醇-丙酮醯(pyrovyl)-莽草酸酯-3-磷酸酯合成酶)抑制劑、GS(麩醯胺酸合成酶)抑制劑)

產生耐受性的有用植物。以習知的繁殖法(突變技術)而對咪唑啉酮類(例如甲氧咪草煙(imazamox))產生耐受性的作物之例子為 Clearfield®夏日油菜(油菜(Canola))。以基因工程法而對除草劑或除草劑類別產生耐受性的作物之例子包括可以商標 RoundupReady®、Herculex I® 及 LibertyLink®商業上得到之抗嘉磷塞(glyphosate)-及抗固殺草(glufosinate)之玉米品種。

術語“有用植物”應了解為也包括藉由使用能夠合成一或多種選擇性作用毒素(例如已知例如來自產毒素細菌之毒素，特別是該等桿菌屬)的重組 DNA 技術而因此轉變的有用植物。

可以該等基因轉殖植物表現的毒素包括例如殺蟲蛋白質，例如，來自仙人掌桿菌或毛葛桿菌(Bacillus popliae)之殺蟲蛋白質；或來自蘇力桿菌之殺蟲蛋白質，如δ-內毒素(例如，CryIA(b)、CryIA(c)、CryIF、CryIF(a2)、CryIIA(b)、CryIIIA、CryIIIB(b1)或 Cry9c)或植物性殺蟲蛋白質(VIP)(例如，VIP1、VIP2、VIP3 或 VIP3A)；或以細菌選殖之線蟲的殺蟲蛋白質，例如發光菌屬(Photorhabdus spp.)或嗜線蟲桿致病菌屬(Xenorhabdus spp.)，例如發光桿菌(Photorhabdus luminescens)、嗜線蟲致病桿菌(Xenorhabdus nematophilus)；由動物所產生的毒素，如蠍毒素、蜘蛛毒素、黃蜂毒素和其它的昆蟲特異性神經毒素；由真菌所產生的毒素，如鏈黴菌毒素、植物凝集素(如豌豆凝集素、大麥凝集素或雪花蓮凝集素)；凝集素；蛋白酶抑制劑，如酪胺酸抑制劑、絲

胺酸蛋白酶抑制劑、儲藏蛋白(patatin)、半胱氨酸蛋白酶抑制劑、木瓜酵素抑制劑、核蛋白體失活蛋白質(RIP)(如蓖麻毒素、玉米-RIP、雞母珠毒蛋白、絲瓜毒素、肥皂草毒素或苔蘚毒素)；類固醇代謝酵素，如3-羥基類固醇氧化酶、蛻皮類固醇-UDP-糖基轉移酶、膽固醇氧化酶、蛻皮激素抑制劑、HMG-COA-還原酶、離子通道阻斷劑(如鈉或鈣通道阻斷劑)、青春激素酯酶、利尿激素受體、芪合成酶、聯苄合成酶、殼多糖酶和葡聚糖酶。

就本發明的情況而論，應了解δ-內毒素(例如，CryIA(b)、CryIA(c)、CryIF、CryIF(a2)、CryIIA(b)、CryIIIA、CryIIIB(b1)或 Cry9c)或植物性殺蟲蛋白質(VIP)(例如，VIP1、VIP2、VIP3 或 VIP3A)，也明確地包括混雜型毒素、截斷型毒素及改造毒素。混雜型毒素係以該等蛋白質之不同區域的新組合而重組產生(參見例如 WO 02/15701)。截斷型毒素的例子為截斷型 CryIA(b)，其表現在來自 Syngenta Seed SAS 之 Bt11 玉米中，如下列所述。在改造毒素的例子中，置換天然生成之毒素的一或多個胺基酸。在該等胺基酸置換中，較佳地係將非天然存在的蛋白酶辨識序列插入毒素中，如例如在 CryIIIA055 的例子中，將組織蛋白酶-D-蛋白酶辨識序列插入 CryIIIA 毒素中(參見 WO 03/018810)。

該等毒素或能夠合成該等毒素的基因轉殖植物的例子揭示例如在 EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451 878 及 WO 03/052073 中。

製備該等基因轉殖植物的方法通常為熟諳此技藝者已

知且揭述在例如上述的公開中。例如從 WO 95/34656、EP-A-0 367 474、EP-A-0 401 979 及 WO 90/13651 已知 CryI-型脫氧核糖核酸。

在基因轉殖植物中所包括的毒素供給植物對有害昆蟲的耐受性。該等昆蟲可存在於任何昆蟲分類群中，但是尤其常在甲蟲(鞘翅目(Coleoptera))、雙翼昆蟲(雙翅目(Diptera))及蝴蝶(鱗翅目(Lepidoptera))中發現。

已知包含一或多種編碼殺蟲抗性且表現一或多種毒素之基因的基因轉殖植物且其有一些可自市場取得。該等植物之例子為：YieldGard®(表現 CryIA(b)毒素的玉米品種)、YieldGard Rootworm®(表現 CryIIIB(b1)毒素的玉米品種)、YieldGard Plus®(表現 CryIA(b)和 CryIIIB(b1)毒素的玉米品種)、Starlink®(表現 Cry9(c)毒素的玉米品種)、Herculex I®(表現 CryIF(a2)毒素和酵素膦絲菌素(phosphinothricine)N-乙醯基轉移酶(PAT)的玉米品種，達成對除草劑固殺草銨的耐受性)、NuCOTN 33B®(表現 CryIA(c)毒素的棉品種)、Bollgard I®(表現 CryIA(c)毒素的棉品種)、Bollgard II®(表現 CryIA(c)和 CryIIA(b)毒素的棉品種)、VIPCOT®(表現 VIP 毒素的棉品種)、NewLeaf®(表現 CryIIIA 毒素的馬鈴薯品種)、Nature-Gard®及 Protecta®。

該等基因轉殖作物之另外的例子為：

1. Btll 玉米，來自法國，Chemin de I' Hobit 27，F-31 790 St.Sauveur 之 Syngenta Seeds SAS，註冊號 C/FR/96/05/10。基因改造玉米，其已藉由截斷型 CryIA(b)毒素的基

因轉殖表現而對歐洲玉米螟(歐洲玉米螟(Ostrinia nubilalis)及西非蛀莖夜蛾(Sesamia nonagrioides))的侵襲產生抗性。Btll 玉米也以基因轉殖表現酵素 PAT 而達成對除草劑固殺草銨的耐受性。

2. Bt176 玉米，來自法國，Chemin de I' Hobit 27，F-31790 St.Sauveur之 Syngenta Seeds SAS，註冊號 C/FR/96/05/10。基因改造玉米，其已藉由 CryIA(b)毒素的基因轉殖表現而對歐洲玉米螟(歐洲玉米螟(Ostrinia nubilalis)及西非蛀莖夜蛾(Sesamia nonagrioides))的侵襲產生抗性。Bt176 玉米也以基因轉殖表現酵素 PAT 而達成對除草劑固殺草銨的耐受性。

3. MIR604 玉米，來自法國，Chemin de I' Hobit 27，F-31 790 St.Sauveur 之 Syngenta Seeds SAS，註冊號 C/FR/96/05/10。玉米，其已藉由改造型 CryIIIA 毒素的基因轉殖表現而提供昆蟲抗性。此毒素為以插入組織蛋白酶-D-蛋白酶辨識序列所改造的 Cry3A055。該等基因轉殖玉米植物的製備揭述在 WO 03/018810 中。

4. MON 863 玉米，來自比利時，布魯賽爾 270-272 de Tervuren 大道，B-1150 之 Monsanto Europe S.A.，註冊號 C/DE/02/9。MON863 表現 CryIIIB(b1)毒素及對特定的鞘翅目昆蟲具有抗性。

5. IPC 531 棉，來自比利時，布魯賽爾 270-272 de Tervuren 大道，B-1150 之 Monsanto Europe S.A.，註冊號 C/ES/96/02；

6. 1507 玉米，來自比利時，布魯賽爾 Tedesco 大道，7B-1160 之 Pioneer Overseas 公司，註冊號 C/NL/00/10。達成對某些鱗翅目昆蟲的抗性之蛋白質 Cry1F 的表現以及達成對除草劑固殺草銨的耐受性的 PAT 蛋白質的表現之基因改造玉米。

7. NK630 x MON 810 玉米，來自比利時，布魯賽爾 270-272 大道 de Tervuren，B-1150 之 Monsanto Europe S.A.，註冊號碼 C/GB/02/M3/03。由藉由基因改造品種 NK603 與 MON 810 交配繁殖的習知混雜型玉米品種所組成的。NK630 x MON 810 玉米基因轉殖表現蛋白質 CP4 EPSPS，得自農桿菌屬(Agrobacterium SP.)株 CP4，其對除草劑 Roundup®(包括嘉磷塞)產生耐受性，並也表現得自蘇力菌亞屬庫斯塔克(Bacillus thuringiensis subsp.Kurstaki)的 CryIA(b)毒素，其對某些鱗翅目(包括歐洲玉米螟)具有耐受性。

抗昆蟲性植物的基因轉殖作物也揭述於 BATS(Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit，Zentrum BATS，Clarastrasse 13，4058 巴塞爾，瑞士)報告 2003(http://bats.ch)中。

術語“有用植物”應了解為也包括已使用能夠合成具有選擇性作用的抗致病性物質(如例如所謂的“病原性相關蛋白質”)的重組 DNA 技術而因此轉型的有用植物(PRPs，參見例如 EP-A-0 392 225)。例如從 EP-A-0 392 225、WO 95/33818 及 EP-A-O 353 191 已知該等抗致病性物質及能夠

合成該等抗致病性物質之基因轉殖植物的例子。產生該等基因轉殖植物之方法通常為熟諳此技藝者已知的且揭述在例如上述公開中。

可被該等基因轉殖植物表現的抗致病性物質包括例如離子通道阻斷劑(如鈉和鈣通道阻斷劑，例如病毒 KP1、KP4 或 KP6 毒素)；芪合成酶；聯苄合成酶；殼多糖酶；葡聚糖酶；所謂的“致病相關蛋白質”(PRPs，參見例如 EP-A-0 392 225)；由微生物所產生的抗致病性物質，例如，肽抗體或雜環型抗體(參見例如 WO 95/33818)或涉及植物致病防禦的蛋白質或多肽因子(所謂的”植物疾病抗性基因”，如 WO 03/000906 中所述)。

關於本發明提高興趣的有用植物為穀類；大豆；稻米；油菜；仁果；核果；花生；咖啡；茶；草莓；草皮；葡萄樹及蔬菜類，如蕃茄、馬鈴薯、葫蘆及萵苣。

術語有用植物的“所在地”如使用在本文中意欲包含有用植物生長的地方、有用植物的植物繁殖物質播種的地方或將有用植物的繁殖物質將放入的土壤中。該類所在地的例子為農作植物生長的田地。

術語有用植物的“所在地”如使用在本文中意欲包含有用植物生長的地方、有用植物的植物繁殖物質播種的地方或有用植物的繁殖物質將放入的土壤中。該類所在地的例子為農作植物生長的田地。

術語“植物繁殖物質”應了解為表示植物的生殖部分，例如種子，其可用於後者之繁殖，和營養生長物質例

如插枝和塊莖(例如，馬鈴薯)。可提及者，例如，種子(狹義)、根、果實、塊莖、球莖、根莖、植物的部分。也可提及其在發芽之後或從土壤萌芽之後將被移植之芽苗和幼苗。這些幼苗可在移植之前藉由浸漬而整株或部分處理來保護。應瞭解較佳的“植物繁殖物質”表示種子。

本發明之進一步觀點為一種保護取自然生命週期的植物及/或動物源的天然物質及/或其加工形式之方法，其包含將增效有效量之成分 A)與 B)之組合物施用至該植物及/或動物源之天然物質或其加工形式。

根據本發明，術語"取自然生命週期的植物源之天然物質"表示以自然生命週期所收割且於新鮮收割形式之植物或其部分。該等植物源之天然物質的例子為莖、葉、塊莖、種子、果實或穀粒。根據本發明，術語"植物源之天然物質的加工形式"被了解為表示改良加工之結果的植物源之天然物質的形式。該等改良加工可用以將植物源之天然物質轉換成一較或多種該類物質的儲存形式(存儲貨品)。該等改良加工之例子為預乾燥、濕潤、壓碎、粉碎、研磨、壓縮或烘焙。也屬於植物源的天然物質之加工形式定義者為木材，不論為原木形式，例如建築木材、電塔和柵欄，或為製成品形式，例如從木材製造之家具或物體。

根據本發明，術語"取自然生命週期的動物源之天然物質及/或其加工形式"被了解為表示動物源之物質例如皮、獸皮、革、毛皮、毛髮及類似物。

根據本發明之組合物也可用於防止不利的影響例如腐

敗、變色或黴菌。

一較佳具體實例為一種保護取自然生命週期的植物源之天然物質及/或它們的加工形式不受真菌侵襲之方法，其包含將增效有效量之成分 A)和 B)之組合物施用至該植物之天然物質及/或它們的加工形式。

另一較佳具體實例為一種保護取自然的生命週期的果實(以仁果類、核果類、漿果類及柑桔類果實較佳)及/或它們的加工形式之方法，其包含將增效有效量之成分 A)和 B)之組合物施用至該植物之天然物質及/或它們的加工形式。

本發明的組合物也可使用在保護工業材料不受真菌侵襲之領域。根據本發明，術語“工業材料”指示已被製備用於在工業中的非活材料。例如，意欲保護不受真菌侵襲之工業材料可為膠、膠料、紙、板、紡織品、地毯、皮革、木材、建築、油漆、塑膠物件、冷卻潤滑劑、水性液壓液及其他可被微生物侵擾或分解之材料。從在欲保護之材料當中，也可提及因微生物繁殖而受損的冷卻和加熱系統、抽風和空調系統及製造工廠的零件，例如冷卻水循環。根據本發明之組合物也可用於防止不利的影響例如腐敗、變色或黴菌。

本發明的組合物也可使用在保護科技材料不受真菌侵襲之領域。根據本發明，術語“科技材料”包括紙；地毯；建築物；冷卻和加熱系統；抽風和空調系統及類似物。根據本發明之組合也可用於防止不利的影響例如腐敗、變色或黴菌。

根據本發明的組合物對抗白粉病；銹病；葉斑病；早疫病和黴菌；尤其對抗在穀物中的殼針孢屬、銹病菌屬、白粉病菌屬、腔菌屬(Pyrenophora)和擬小尾孢屬(Tapesia)；在大豆中的層鏽菌屬(Phakopsora)；在咖啡中的鏽病菌屬(Hemileia)；在玫瑰中的玫瑰銹病菌屬(Phragmidium)；在馬鈴薯、蕃茄和葫蘆中的馬鈴薯葉燒病菌屬(Alternaria)；在草坪、蔬菜、向日葵和油菜中的菌核病菌屬(Sclerotinia)；在葡萄樹中的黑腐病、紅火蟻、白粉病、灰黴病和枝枯病；在果實中的灰黴菌(Botrytis cinerea)；在果實中的鏈核盤菌屬(Monilinia spp.)和在果實中的青黴菌屬(Penicillium spp.)特別有效。

根據本發明的組合物此外對抗種苗傳播性及土壤傳播性病害，例如馬鈴薯葉燒病菌(Alternaria spp.)、豌豆斑莢病菌屬(Ascochyta spp.)、灰黴菌、蒜菜斑點病菌屬(Cercospora spp.)、麥角病(Claviceps purpurea)、麥類斑點病菌(Cochliobolus sativus)、棉黑斑病菌屬(Colletotrichum spp.)、萎蕤斑點病屬(Epicoccum spp.)、禾穀鐮刀菌(Fusarium graminearum)、串珠鐮刀菌(Fusarium moniliforme)、尖鐮孢黴(Fusarium oxysporum)、層出鐮刀菌(Fusarium proliferatum)、腐皮鐮孢菌(Fusarium solani)、亞黏團串珠鐮刀菌(Fusarium subglutinans)、禾穀頂囊殼(Gäumannomyces graminis)、麥類胡麻葉斑菌屬(Helminthosporium spp.)、雪黴葉枯菌(Microdochium nivale)、莖點黴屬(Phoma spp.)、大麥斑葉病菌(Pyrenophora

graminea)、稻熱病菌(Pyricularia oryzae)、立枯絲核菌(Rhizoctonia solani)、麥紋枯病菌(Rhizoctonia cerealis)、菌核病菌屬(Sclerotinia spp.)、殼針孢屬(Septoria spp.)、絲軸黑粉菌(Sphacelotheca reiliana)、腥黑穗病菌屬(Tilletia spp.)、麥類雪腐褐色小粒菌核病菌(Typhula incarnata)、黑麥桿黑穗病菌(Urocystis occulta)、黑穗病菌屬(Ustilago spp.)或輪黴菌屬(Verticillium spp.)；特別是對抗穀類，例如小麥、大麥、裸麥或燕麥；玉米；稻米；棉；大豆；草坪；甜菜；油菜；馬鈴薯；豆類作物，例如豌豆、扁豆或雞兒豆；和向日葵之病原體特別有效。

根據本發明的組合物對抗採後病害(post harvest diseases)，如灰黴菌、香蕉炭疽病菌(Colletotrichum musae)、新月彎孢菌(Curvularia lunata)、半裸鐮刀菌(Fusarium semitecum)、白地黴菌(Geotrichum candidium)、桃褐腐病菌(Monilinia fructicola)、寄生鏈核盤菌(Monilinia fructigena)、核果褐腐菌(Monilinia laxa)、梨狀毛黴菌(Mucor piriformis)、柑桔青黴病菌(Penicillium italicum)、離生青黴菌(Penicillium solitum)、指狀青黴菌(Penicillium digitatum)或擴展青黴菌(Penicillium expansum)，特別是對抗果實，如仁果類，例如，蘋果和梨、核果類，例如桃子和李子、柑橘、甜瓜、木瓜、奇異果、芒果、漿果，例如，草莓、酪梨、石榴及香蕉；以及堅果類的病原體特別有效。

欲施用之本發明組合物的量將視各種因素，如所使用之化合物；處理之標的(如例如植物、土壤或種子)；處理形

式(如例如噴霧、灑粉或拌種)；處理目的(如例如預防或治療)；欲控制之真菌類型或施用時間而定。

頃發現與式 I 化合物組合使用的成分 B)令人意外地且實質上增強式 I 化合物對抗真菌的有效性，且反之亦然。此外，本發明的方法有效對抗更廣範圍的真菌，其單獨使用時，可以此方法的活性成分攻擊。

選自表 1 之式 I 化合物與上述活性成分 B)的活性成分混合物包含選自表 1 之化合物與上述活性成分，其較佳係於從 1000：1 至 1：1000，特別是從 50：1 至 1：50 之混合比，更特別是從 20：1 至 1：20，甚至更特別是從 10：1 至 1：10，非常特別是從 5：1 和 1：5 之比，特佳者為從 2：1 至 1：2 之比，從 4：1 至 2：1 之比同樣為較佳，尤其是於 1：1、或 5：1、或 5：2、或 5：3、或 5：4、或 4：1、或 4：2、或 4：3、或 3：1、或 3：2、或 2：1、或 1：5、或 2：5、或 3：5、或 4：5、或 1：4、或 2：4、或 3：4、或 1：3、或 2：3、或 1：2、或 1：600、或 1：300、或 1：150、或 1：35、或 2：35、或 4：35、或 1：75、或 2：75、或 4：75、或 1：6000、或 1：3000、或 1：1500、或 1：350、或 2：350、或 4：350、或 1：750、或 2：750、或 4：750 之比。應了解那些混合比一方面包括重量比以及，在另一方面，包括莫耳比。

包含選自表 1 之式 I 化合物與一或更多上述活性成分之混合物可以例如以單一“預拌混合物”形式、得自單一活性組分成分的分開調配物的組合噴霧混合物，如“槽混合

物”，及當以順序方式施用，即在以合理的短期間內，如幾小時或幾天內一個接一個地施用時的單一活性成分之組合使用而施用。施用選自表1之式I化合物及上述活性成分的順序不是實行本發明之必要條件。

從A)+B)之組成物的殺真菌活性大於A)和B)之殺真菌活性的總和之事實顯而易見組合物的增效活性。

本發明的方法包含將成分A)和成分B)化合物之增效有效總額以摻合物或分開施用至有用植物、其所在地或其繁殖物質。

一些該等根據本發明的組合物具有系統作用且可作為葉片、土壤及種子處理殺真菌劑使用。

使用根據本發明之組合物，可能抑制或破壞出現在不同有用植物中的植物或植物的部份(果實、花、葉、莖、塊莖、根)中的植物病原性微生物，同時也防止稍後生長的植物部份受到病原性微生物的侵襲。

本發明的組合物特別感興趣於控制許多在各種有用植物或其種子中，尤其在農地作物中，如馬鈴薯、煙草和甜菜、及在園藝業和葡萄栽培學中的小麥、稞麥、大麥、燕麥、稻米、玉米、草坪、棉、大豆、油菜、豆類農作物、向日葵、咖啡、甘蔗、果實及觀賞植物；在蔬菜類中，如黃瓜、大豆和葫蘆的真菌。

以施用根據本發明的組合物予以處理真菌，以增效有效量之成分A)與B)之組合物襲擊被真菌威脅之有用植物、其所在地、其繁殖物質、取自然生命週期的植物及/或動物

源天然物質及/或其加工型式、或工業材料。

根據本發明的組合物可在有用植物、其繁殖物質、取自然生命週期的植物及/或動物源的天然物質及/或其加工形式，或工業材料被真菌感染之後或之前施用。

根據本發明的組合物用於控制下列的植物疾病特別地有效：

在果實及蔬菜類中的馬鈴薯葉燒病菌屬(Alternaria)種類、

在豆類作物中的豌豆斑莢病菌屬(Ascochyta)種類、

在草莓、蕃茄、向日葵、豆類作物及葡萄中的灰黴菌、

在落花生中的落花生褐斑病菌(Cercospora arachidicola)、

在穀物中的麥類斑點病菌(Cochliobolus sativus)、

在豆類作物中的棉黑斑病菌屬(Colletotrichum)種類、

在穀物中的白粉病菌種類、

在葫蘆中的二孢白粉菌(Erysiphe cichoracearum)及單絲殼菌(Sphaerotheca fuliginea)、

在穀物及玉米中的鐮菌屬種類、

在穀物及草坪中的禾穀頂囊殼、

在玉米、稻和馬鈴薯中的斑葉病菌種類、

在咖啡上的駝孢銹病菌(Hemileia vastatrix)、

在小麥及裸麥中的微結節菌屬(Microdochium)種類、

在大豆中的層鏽菌屬種類、

在穀物、闊葉作物和多年生植物中的銹病菌屬種類、

在穀物中的基腐病菌(Pseudocercosporella)屬種類、

在玫瑰中的玫瑰銹病菌屬(Phragmidium mucronatum)、

在果實中的蘋果白澀病菌屬種類、

在大麥中的腔菌屬種類、

在稻米中的稻熱病菌、

在大麥中的 Ramularia collo-cygni、

在棉、大豆、穀物、玉米、馬鈴薯、稻米及草坪中的馬鈴薯黑痣病菌屬種類、

在大麥和裸麥中的雲紋病菌(Rhynchosporium secalis)、

在草坪、萬苣、蔬菜和油菜中的菌核病菌屬種類、

在穀類、大豆和蔬菜中的殼針孢屬種類、

在玉米中的黑穗病菌(Sphacelotheca reilliana)、

在穀物中的腥黑穗病菌屬種類、

在葡萄樹中的葡萄白粉病(Uncinula necator)、葡萄球座菌(Guignardia bidwellii)和葡萄蔓割病(Phomopsis viticola)、

在裸麥中的黑麥桿黑穗病菌、

在穀物及玉米中的黑穗病菌屬(Ustilago)種類、

在果實上的蘋果黑星病菌屬種類、

在果實中的鏈核盤菌屬種類、

在柑橘和蘋果上的青黴菌屬種類。

根據本發明的組合物在有害生物控制領域中為有預防及/或治病價值的活性成分，甚至於低施用率時，其具有非常有利的殺生物範圍且被溫血物種、魚及植物良好耐受。

部分已知其殺蟲作用之根據本發明活性成分具有對抗一般敏感，但是也對抗藥性之動物有害生物(例如昆蟲或蜱蟎目代表)的所有或各個發育階段的作用。根據本發明的組合物之殺蟲或殺蟎活性可以本身直接顯現，即有害生物的破壞，其立即或只在經一段時間之後發生，例如，在蛻化期間，或間接發生，例如，降低產卵率及/或孵化率，具有對應於至少 50 至 60%之破壞率(致死率)的良好活性。

上述動物有害生物的例子為：

選自蜱蟎目(Acarina)，例如，

粗足粉蟎(Acarus siro)、瘤癭蟎(Aceria sheldoni)、斯氏刺癭蟎(Aculus schlechtendali)、花蜱屬(Amblyomma spp.)、銳緣蜱屬(Argas spp.)、牛蜱屬(Boophilus spp.)、短須蟎屬(Brevipalpus spp.)、苜蓿苔蟎(Bryobia praetiosa)、褐毛柳節蜱屬(Calipitrimerus spp.)、足蟎屬(Chorioptes spp.)、雞虱(Dermanyssus gallinae)、鵝耳櫪始葉蟎(Eotetranychus carpini)、癭蟎屬(Eriophyes spp.)、璃眼蜱屬(Hyalomma spp.)、硬蜱屬(lxodes spp.)、草地小爪蟎(Olygonychus pratensis)、鈍緣蜱屬(Ornithodoros spp.)、葉蟎屬(Panonychus spp.)、柑桔銹蜱(Phyllocoptruta oleivora)、側多食跗線蟎(Polyphagotarsonemus latus)、癢蟎屬(Psoroptes spp.)、扇頭壁蝨屬(Rhipicephalus spp.)、根蟎屬(Rhizoglyphus spp.)、疥蟲屬(Sarcoptes spp.)、附線蟎(Tarsonemus spp.)和葉蟎屬(Tetranychus spp.)；

選自蝨目(Anoplura)，例如，

血虱屬(Haematopinus spp.)、長顎虱屬(Linognathus spp.)、虱屬(Pediculus spp.)、癭綿蚜屬(Pemphigus spp.)和根瘤蚜屬(Phylloxera spp.)；

選自鞘翅目(Coleoptera)，例如，

叩甲屬(Agriotes spp.)、花象甲屬(Anthonomus spp.)、甜菜隱食甲(Atomaria linearis)、甜菜莖跳甲(Chaetocnema tibialis)、根象甲屬(Cosmopolites spp.)、象鼻蟲屬(Curculio spp.)、皮蠹屬(Dermestes spp.)、條葉甲屬(Diabrotica spp.)、植瓢蟲屬(Epilachna spp.)、荒漠群落屬(Eremnus spp.)、馬鈴薯甲蟲(Leptinotarsa decemlineata)、稻象甲屬(Lissorhoptrus spp.)、鰓金龜屬(Melolontha spp.)、鋸稻谷屬(Orycaephilus spp.)、草莓根象甲屬(Otiorhynchus spp.)、水稻象鼻蟲屬(Phlyctinus spp.)、麗金龜屬(Popillia spp.)、跳甲屬(Psylliodes spp.)、動根蠹屬(Rhizopertha spp.)、金龜甲科(Scarabeidae)、穀象屬(Sitophilus spp.)、麥蛾屬(Sitotroga spp.)、擬步行蟲屬(Tenebrio spp.)、擬穀盜屬(Tribolium spp.)、和皮蠹屬(Trogoderma spp.)；

選自雙翅目(Diptera)，例如，

斑蚊屬(Aedes spp.)、高粱桿蠅(Antherigona soccata)、花園毛蟲(Bibio hortulanus)、紅頭麗蠅(Calliphora erythrocephala)、果蠅屬(Ceratitis spp.)、金蠅屬(Chrysomyia spp.)、家蚊屬(Culex spp.)、蛆蠅屬(Cuterebra spp.)、寡毛實蠅屬(Dacus spp.)、黃果蠅(Drosophila melanogaster)、廁蠅屬(Fannia spp.)、馬蠅屬(Gastrophilus spp.)、舌蠅屬

(Glossina spp.)、皮蠅屬(Hypoderma spp.)、蝨蠅屬(Hyppobosca spp.)、斑潛蠅屬(Liriomyza spp.)、綠蠅屬(Lucilia spp.)、根潛蠅屬(Melanagromyza spp.)、蒼蠅屬(Musca spp.),、狂蠅屬(Oestrus spp.)、稻癭蚊屬(Orseolia spp.)、麥桿蠅(Oscinella frit)、甜菜潛葉蠅(Pegomyia hyoscyami)、草種蠅屬(Phorbia spp.)、蘋果實蠅(Rhagoletis pomonella)、蚋屬(Sciara spp.)、廄蠅屬(Stomoxys spp.)、虻屬(Tabanus spp.)、肉條蟲屬(Tannia spp.)和大蚊屬(Tipula spp.)；

選自異翅目(Heteroptera)，例如，

臭蟲屬(Cimex spp.)、可可瘤盲蝽(Distantiella theobroma)、星蝽屬(Dysdercus spp.)、麻皮蝽屬(Euchistus spp.)、扁盾蝽屬(Eurygaster spp.)、緣蝽屬(Leptocorisa spp.)、綠蝽屬(Nezara spp.)、皮蝽屬(Piesma spp.)、皮蝽屬(Rhodnius spp.)、可可褐盲蝽(Sahlbergella singularis)、黑蝽屬(Scotinophara spp.)和錐鼻蟲屬(Triatoma spp.)；

選自同翅目(Homoptera)，例如，

絲絨粉蝨(Aleurothrixus floccosus)、大菜粉蝨(Aleyrodes brassicae)、介殼蟲屬(Aonidiella spp.)、蚜科(Aphididae)、蚜屬(Aphis spp.)、圓盾介殼屬(Aspidiotus spp.)、菸草粉蝨(Bemisia tabaci)、龜蠟介殼蟲屬(Ceroplaster spp.)、佛羅里達介殼蟲(Chrysomphalus aonidium)、蜜柑灰色介殼蟲(Chrysomphalus dictyospermi)、扁堅介殼蟲(Coccus hesperidum)、小綠葉蟬屬(Empoasca spp.)、蘋果綿

蚜(Eriosoma larigerum)、斑葉蟬屬(Erythroneura spp.)、白蠟介殼蟲屬(Gascardia spp.)、飛蝨屬(Laodelphax spp.)、山茱萸介殼(Lecanium corni)、盾介殼蟲屬(Lepidosaphes spp.)、長管蚜屬(Macrosiphus spp.)、瘤蚜屬(Myzus spp.)、黑尾葉蟬屬(Nephotettix spp.)、褐飛蝨屬(Nilaparvata spp.)、片盾介殼蟲屬(Parlatoria spp.)、癭棉蚜屬(Pemphigus spp.)、粉介殼蟲屬(Planococcus spp.)、白盾介殼蟲屬(Pseudaulacaspis spp.)、粉介殼蟲屬(Pseudococcus spp.)、木蝨屬(Psylla spp.)、海芋棉蠟介殼蟲(Pulvinaria aethiopica)、圓盾介屬(Quadraspidiotus spp.)、縊管蚜屬(Rhopalosiphum spp.)、珠蠟介殼蟲屬(Saissetia spp.)、帶葉蟬屬(Scaphoideus spp.)、二叉蚜屬(Schizaphis spp.)、谷岡蚜屬(Sitobion spp.)、溫室粉蝨(Trialeurodes vaporariorum)、非洲木蝨(Trioza erytreae)和柑桔尖盾介殼蟲(Unaspis citri)；

選自膜翅目(Hymenoptera)，例如，

切葉蟻屬(Acromyrmex)、切葉蟻屬(Atta spp.)、莖蜂屬(Cephus spp.)、松鋸蜂屬(Diprion spp.)、鋸角葉蜂科(Diprionidae)、素衣藻松葉蜂(Gilpinia polytoma)、梨實蜂屬(Hoplocampa spp.)、斜結蟻屬(Lasius spp.)、小黃家蟻(Monomorium pharaonis)、鋸角蜂屬(Neodiprion spp.)、火蟻屬(Solenopsis spp.)和胡蜂屬(Vespa spp.)；

選自等翅目(Isoptera)，例如，

散白蟻屬(Reticulitermes spp.)；

選自鱗翅目(Lepidoptera)，例如，

捲葉蛾屬(Acleris spp.)、茶姬捲葉蛾屬(Adoxophyes spp.)、透翅蛾屬(Aegeria spp.)、地老虎(Agrotis spp.)、棉葉波紋夜蛾(Alabama argillaceae)、金雙點螟屬(Amylois spp.)、黎豆夜蛾(Anticarsia gemmatalis)、黃捲蛾屬(Archips spp.)、帶捲蛾屬(Argyrotaenia spp.)、銀紋夜蛾屬(Autographa spp.)、玉米楷夜蛾(Busseola fusca)、粉斑螟(Cadra cautella)、桃小食心蟲(Carposina nipponensis)、禾草螟屬(Chilo spp.)、捲蛾屬(Choristoneura spp.)、葡萄螟蛾(Clysia ambiguella)、縱卷葉螟屬(Cnaphalocrocis spp.)、雲捲蛾屬(Cnephasia spp.)、細捲葉蛾屬(Cochylis spp.)、落葉蛾屬(Coleophora spp.)、大菜螟(Crocidolomia binotalis)、蘋果異形小捲蛾(Cryptophlebia leucotreta)、蠹蛾屬(Cydia spp.)、異草螟屬(Diatraea spp.)、展葉松夜蛾(Diparopsis castanea)、鑽夜蛾屬(Earias spp.)、粉斑螟屬(Ephestia spp.)、葉蛾屬(Eucosma spp.)、女貞細卷蛾(Eupoecilia ambiguella)、毒蛾屬(Euproctis spp.)、切夜蛾屬(Euxoa spp.)、Grapholita spp.、廣翅小捲蛾(Hedya nubiferana)、棉鈴蟲屬(Heliothis spp.)、菜心野螟(Hellula undalis)、美國白蛾(Hyphantria cunea)、番茄蠹蛾(Keiferia lycopersicella)、旋紋潛蛾(Leucoptera scitella)、細紋蛾屬(Lithocollethis spp.)、鮮食葡萄小卷蛾(Lobesia botrana)、毒蛾屬(Lymantria spp.)、潛蛾屬(Lyonetia spp.)、天幕毛蟲屬(Malacosoma spp.)、甘藍夜蛾(Mamestra brassicae)、煙草天蛾(Manduca sexta)、尺蛾屬(Operophtera spp.)、歐洲玉米螟(Ostrinia

nubilalis)、超小捲蛾屬(Pammene spp.)、褐捲蛾屬(Pandemis spp.)、冬夜蛾(Panolis flammea)、棉紅鈴蟲(Pectinophora gossypiela)、馬鈴薯蠹蛾(Phthorimaea operculella)、紋白蝶(Pieris rapae)、紋白蝶屬(Pieris spp.)、小菜蛾(Plutella xylostella)、巢蛾屬(Prays spp.)、三化螟屬(Scirpophaga spp.)、大螟屬(Sesamia spp.)、長須捲蛾屬(Sparganothis spp.)、斜紋夜蛾屬(Spodoptera spp.)、透翅蛾屬(Synanthedon spp.)、帶蛾屬(Thaumetopoea spp.)、捲葉蛾屬(Tortrix spp.)、擬尺蠖(Trichoplusia ni)和巢蛾屬(Yponomeuta spp.)；

選自食毛目(Mallophaga)，例如，

多乳嘴絲狀蟲屬(Damalinea spp.)和嚙毛虱屬(Trichodectes spp.)；

選自直翅目(Orthoptera)，例如，

蜚蠊屬(Blatta spp.)、黑尾蜚蠊(Blattella spp.)、螻蛄屬(Gryllotalpa spp.)、佛羅里達蟑螂(Leucophaea maderae)、飛蝗屬(Locusta spp.)、大蠊屬(Periplaneta spp.)和沙漠蝗屬(Schistocerca spp.)；

選自嚙蟲目(Psocoptera)，例如，

書虱屬(Liposcelis spp.)；

選自蚤目(Siphonaptera)，例如，

角葉蚤屬(Ceratophyllus spp.)、頭梳蚤屬(Ctenocephalides spp.)和印度鼠蚤(Xenopsylla cheopis)；

選自纓翅目(Thysanoptera)，例如，

薊馬屬(Frankliniella spp.)、薊馬屬(Hercinothrips

spp.)、非洲桔硬薊馬(Scirtothrips aurantii)、薊馬屬(Taeniothrips spp.)、南黃薊馬(Thrips palmi)和蔥薊馬(Thrips tabaci)；

選自纓尾目(Thysanura)，例如，

衣魚(Lepisma saccharina)；

線蟲，例如根結線蟲(root knot nematodes)、莖線蟲(stem eelworms)和葉線蟲(foliar nematodes)；尤其是包囊線蟲屬(Heterodera spp.)，例如甜菜胞囊線蟲(Heterodera schachtii)、燕麥異皮線蟲(Heterodora avenae)及車軸草異皮線蟲(Heterodora trifolii))；包囊線蟲屬(Globodera spp.)，例如馬鈴薯黃金線蟲(Globodera rostochiensis)；根瘤線蟲屬(Meloidogyne spp.)，例如西瓜根瘤線蟲(Meloidogyne incoginita)和爪哇根瘤線蟲(Meloidogyne javanica)；穿孔線蟲屬(Radopholus spp.)，例如香蕉穿孔線蟲(Radopholus similes)；根腐線蟲(Pratylenchus)，例如 Pratylenchus neglectans 和北方根腐線蟲(Pratylenchus penetrans)；半穿刺蟲(Tylenchulus)，例如柑桔線蟲(Tylenchulus semipenetrans)；針線蟲(Longidorus)、殘根線蟲(Trichodorus)、劍線蟲(Xiphinema)、莖線蟲(Ditylenchus)、葉芽線蟲(Aphelenchoides)和粒線蟲(Anguina)；

菜跳仔(跳甲屬(Phyllotreta spp.)；

根蛆(種蠅屬(Delia spp.)和

包心菜種象鼻蟲(龜象屬(Ceutorhynchus spp.))。

根據本發明的組合物可用於控制(即圍堵或摧毀)出現

在農業、園藝及森林中的有用植物上或有用植物的組織上(如果實、花朵、葉片、莖、塊莖或根)的上述類型之動物有害生物，並在一些例子中，甚至在稍後時間點形成的有用植物之組織上仍及時防止這些動物有害生物。

當施用至有用植物時，將式I化合物以5至2000克活性成分/公頃之比例(特別為10至1000克活性成分/公頃，例如50、75、100或200克活性成分/公頃)連同1至5000克活性成分/公頃(特別為2至2000克活性成分/公頃，例如100、250、500、800、1000、1500克活性成分/公頃)之成分B)化合物一起施用，視作為成分 B)使用的之化學品類別而定。

在農業實務中，根據本發明的組合物之施用率視所要的效果類型而定，並典型地範圍為以每公頃計從20至4000克總組合物。

當使用根據本發明的組合物處理種子時，以每公斤種子計0.001至50克之式I化合物及以每公斤種子計0.001至50克成分B)(較佳為每公斤種子計從0.01至10克)的化合物之比例通常是足夠的。

本發明也提供殺真菌組成物，其包含增效有效量之上述成分A)和B)的組成物，與農業上可接受之載體，及視需要選擇的界面活性劑一起。在該等組成物中，A)對 B)之重量比較佳係介於1000:1至1:1000之間。

本發明的組成物可以任何習用的形式來使用，例如，具有雙包裝、乾種子處理用之粉劑(DS)、種子處理用之乳液

(ES)、種子處理用之可流動性濃縮劑(FS)、種子處理用之溶液(LS)、種子處理用之水分散性粉劑(WS)、種子處理用之膠囊懸浮劑(CF)、種子處理用之凝膠(GF)、乳液濃縮劑(EC)、懸浮濃縮劑(SC)、懸浮乳液(SE)、膠囊懸浮劑(CS)、水分散性粒劑(WG)、可乳化性粒劑(EG)、油包水型乳液(EO)、水包油型乳液(EW)、微乳液(ME)、分散性油懸劑(OD)、油懸劑(OF)、油溶性液劑(OL)、可溶性濃縮劑(SL)、超低容量懸浮劑(SU)、超低容量液劑(UL)、母藥(technical concentrate)(TK)、可分散性濃縮劑(DC)、可濕性粉劑(WP)或與農業上可接受之佐劑類組合的任何技術上可行之調配物形式。

可以習知的方式製備該等組成物，例如藉由混合活性成分與適當的調配惰性劑(稀釋劑、溶劑、填充劑及視需要的其它調配成分，例如界面活性劑、殺生物劑、防凍劑、膠黏劑、增稠劑及提供輔佐效果之化合物)。也可使用意欲達成長期持續藥效的習知緩釋型調配物。特別欲以噴霧形式，如水分散性濃縮物(例如 EC、SC、DC、OD、SE、EW、EO 和類似物)、可濕性粉劑及粒劑施用的調配物可包括界面活性劑例如濕潤劑和分散劑及其它提供輔佐效果之化合物，例如甲醛與萘磺酸鹽、烷芳基磺酸鹽、木質素磺酸鹽、脂肪烷基硫酸鹽及乙氧基化烷基酚和乙氧基化脂肪醇之縮合產物。

使用本發明的組合物及稀釋劑的拌種調配物用本身已知的方式以適合的拌種調配物形式，例如如具有對種子的

良好黏著性之水性懸浮液或乾粉劑形式，而施用至種子。在該技藝中已知該等拌種調配物。該等拌種調配物可包括於封膠形式之單一活性成分或活性成分的組合物，例如為緩釋型膠囊或微膠囊。

通常，調配物包括從 0.01 至 90 重量%之活性成分，從 0 至 20 重量%之農業上可接受之界面活性劑及 10 至 99.99 重量%之固體或液體調配惰性劑和佐劑(類)，該活性劑係由至少式 I 之化合物與成分 B)之化合物一起及視需要的其它活性劑(特別為殺微生物劑或防腐劑或類似物)所組成。組成物之濃縮形式通常包括介於約 2 和 80 重量%之間，較佳介於約 5 和 70 重量%之間的活性劑。調配物之施用形式可例如包括從 0.01 至 20 重量%，較佳從 0.01 至 5 重量%之活性劑。然而較佳地係將市售產品調配成濃縮物，使用者通常使用稀釋的調配物。

以下的實施例用以說明本發明，“活性成分”表示於特定混合比之式 I 化合物與成分 B)化合物的混合物。

調配例

可濕性粉劑

成分	a)	b)	c)
活性成分(I：成分 B) = 1：3(a)，1：2(b)，1：1(c)]	25%	50%	75%
木質素磺酸鈉	5%	5%	-
月桂基硫酸鈉	3%	-	5%
二異丁基萘磺酸鈉	-	6%	10%

酚聚乙二醇醚	-	2%	-
（7至8莫耳之氧化乙烯單元）			
高分散矽酸	5%	10%	10%
高嶺土	62%	27%	-

徹底混合活性成分與佐劑及在適合的研磨機中徹底研磨混合物，產生可濕性粉劑，其可用水稀釋以產生所要濃度的懸浮液。

乾種子處理用之粉劑	a)	b)	c)
活性成分[I：成分 B]=1：3(a)，	25%	50%	75%
1：2(b)，1：1(c)]			
輕質礦物油	5%	5%	5%
高分散性矽酸	5%	5%	-
高嶺土	65%	40%	-
滑石粉	-		20

徹底混合活性成分與佐劑及在適合的研磨機中徹底研磨混合物，產生可直接用於種子處理的粉劑。

乳劑(Emulsifiable concentrate)

活性成分(I：成分 B)＝1：6)	10%
辛酚聚乙二醇醚(4-5 莫耳之氧化乙烯)	3%
十二烷基苯磺酸鈣	3%
蓖麻油聚乙二醇醚(35 莫耳之氧化乙烯)	4%
環己酮	30%
二甲苯混合物	50%

藉由用水稀釋可從此濃縮物獲得任何所要稀釋之乳液，其可使用於植物保護。

粉劑	a)	b)	c)
活性成分[I：成分 B]=1：6(a)，1：2(b)，1：10(c)]	5%	6%	4%
滑石粉	95%	-	-
高嶺土	-	94%	-
無機填充劑	-	-	96%

藉由混合活性成分與載體及在適合的研磨機中研磨混合物可獲得隨時可用的粉劑。該等粉劑可使用於種子之乾拌種。

擠製粒劑

活性成分(I：成分 B)=2：1)	15%
木質磺酸鈉	2%
羧甲基纖維素	1%
高嶺土	82%

混合及研磨活性成分與佐劑，並用水濕潤混合物。將混合物擠壓及接著在空氣流中乾燥。

塗佈粒劑

活性成分(I：成分 B)=1：10)	8%
聚乙二醇(分子量 200)	3%
高嶺土	89%

在混合器中將細研磨之活性成分均勻地塗覆於以聚乙二醇濕潤的高嶺土。以此方式獲得非粉狀塗佈粒劑。

懸浮濃縮物

活性成分(I：成分 B)=1：8)	40%
丙二醇	10%
壬酚聚乙二醇醚(15 莫耳環氧乙烷)	6%
木質磺酸鈉	10%
羧甲基纖維素	1%
矽烷氧油(在水中的 75%乳液形式)	1%
水	32%

密切混合細研磨之活性成分與佐劑，產生懸浮濃縮物形式，藉由用水稀釋可從其獲得任何所要稀釋之懸浮液。藉由噴霧、傾倒或浸入方式使用該等稀釋液可處理及保護活植物以及植物繁殖物質不受微生物侵襲。

種子處理用之可流動性濃縮劑

活性成分(I：成分 B)=1：8)	40%
丙二醇	5%
共聚物丁醇 PO/EO	2%
具有 10-20 莫耳 EO 之三苯乙烯酚	2%
1,2-苯并異噻唑啉-3-酮(在水中的 20%溶液形式)	0.5%
單偶氮顏料鈣鹽	5%
矽烷氧油(在水中的 75%乳液形式)	0.2%
水	45.3%

密切混合細研磨之活性成分與佐劑，產生懸浮濃縮物形式，藉由用水稀釋可從其獲得任何所要稀釋之懸浮液。

藉由噴霧、傾倒或浸入方式使用該等稀釋液可處理及保護活植物以及植物繁殖物質不受微生物侵襲。

緩釋型膠囊懸浮液

將28份之式I化合物與成分B)化合物的組合物或這些化合物各自單獨與2份芳族溶劑及7份甲苯二異氰酸酯/聚亞甲基-聚苯基異氰酸酯-混合物(8：1)混合。將此混合物乳化於1.2份聚乙烯醇、0.05份除泡劑與51.6份水之混合物中，直到達成所要的粒度為止。將在5.3份水中的2.8份1,6-二胺基己烷之混合物加至此乳液中。攪動混合物，直到完成聚合反應為止。藉由加入0.25份增稠劑及3份分散劑穩定所獲得的膠囊懸浮液。膠囊懸浮調配物包括28%之活性成分。平均膠囊直徑為8-15微米。在適合於其目的之裝置中將所得調配物以水性懸浮液施用至種子。

式I之化合物可以4種立體異構物存在。例如，消旋化合物編號1.001包含下列純光學化合物：

(+)-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[(1R,2S)-2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺；

(-)-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[(1S,2R)-2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺；

(-)-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[(1R,2R)-2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺；及

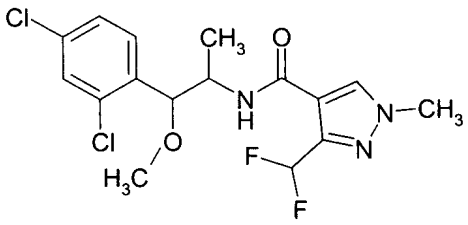
(+)-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[(1S,2S)-2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺。

該等異構物可藉由標準方法，例如以使用手性相管柱

之 HPLC 而分離。例如，化合物編號 1.001 之非鏡像異構物/鏡像異構物可如下製備：

製備例：

實施例 E1：3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺(化合物編號 1.001)之製備：



(1.001)

在 1.5 小時內於 4℃下將 3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-碳醯氯(1206 克，6.20 莫耳)在二氯甲烷(15 升)中的溶液逐滴加至(1354 克，5.78 莫耳)2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙胺和三乙胺(1.68 升，12.04 莫耳)在二氯甲烷(32 升)中的攪拌溶液。關掉冷卻系統且使褐色溶液加溫至室溫(23℃)並攪拌過夜。用 HCl(1M，9.5 升)、NaOH(2M，6.5 升)和鹽水(3.2 升)洗滌溶液，經過硫酸鈉乾燥且在旋轉蒸發器(50℃)上蒸發溶劑。將分離之粗產物(2660 克褐色油)溶解在乙酸乙酯中(5 升)，用結晶種晶且攪拌 1 小時。將溶劑蒸發，產物開始結晶。將殘餘物懸浮在 TBME(5 升)中且在旋轉蒸發器上於 60℃將懸浮液攪拌 30 分鐘。將懸浮液冷卻到 0℃，過濾固體、用冷 TBME(3x1 升)洗滌且在真空烤箱中於 40℃下乾燥。以白色固體的形式獲得 1113 克(理論之 49%)之 3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[2-(2,4-二氯苯基)-2-

甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺的主要非鏡像異構物 A(反側)。

^{1}H NMR(400MHz，$CDCl_3$)：δ 1.01(d，3H，CH_3)，3.31(s，3H，NCH_3)，3.88(s，3H，CH_3)，4.51-4.56(m，1H，CH)，4.69(d，1H，CH)，6.83(m 寬，1H，NH)，6.70-7.00(t，1H，CHF_2)，7.17-7.41(m，3H，Ar-H)，7.93(s，1H，吡唑-H)。

MS $[M+H]^+$ 392/394/396。

在旋轉蒸發器上濃縮母液且以管柱層析法(7000 克矽凝膠，溶析液：庚烷/乙酸乙酯 1：1)純化殘餘物(1309 克褐色油)。將部分 2-7 合併且在旋轉蒸發器上蒸發溶劑。將殘餘物(497 克黃色油)溶解在 MTBE(500 毫升)中且過濾不溶物質。在旋轉蒸發器上蒸餾掉 100 毫升的溶劑，加入庚烷(200 毫升)且用結晶將溶液種晶。化合物結晶之後，過濾固體，用庚烷/TMBE(2：1，1 升)洗滌且在真空烤箱中於 40℃下乾燥固體。以白色固體的形式獲得 204 克(理論的 9%)之 3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺的次要非鏡像異構物 B(同側)。

^{1}H NMR(400MHz，$CDCl_3$)：δ 1.36(d，3H，CH_3)，3.31(s，3H，NCH_3)，3.92(s，3H，CH_3)，4.41-4.46(m，1H，CH)，4.60(d，1H，CH)，6.63(m 寬，1H，NH)，6.70-7.00(t，1H，CHF_2)，7.17-7.41(m，3H，Ar-H)，7.80(s，1H，吡唑-H)。

MS $[M+H]^+$ 392/394/396。

3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺的消旋主要非鏡像異構物 A(反側)(1.26 克，如實施例 1a 中所述製備)係在使用正庚烷

/二氯甲烷 1：1(體積/體積)作為溶析液之 Chiralpak IB®(尺寸；250 毫米x20 毫米，粒度：5 微米，流速：20 毫升/分鐘)上借助於高效液相層析(HPLC)純化。為了整個物質之純化，在管柱上分開進行幾次操作。化合物之檢測係用 UV 檢測器於 254 奈米執行。純鏡像異構物樣品(ee > 99%)係藉由使用正庚烷/二氯甲烷 1：1(v/v)作為溶析液之分析型 HPLC(Chiralpak IB®(尺寸：250 毫米x4.6 毫米，粒度：5 微米，流速：1 毫升/分鐘)借助於 HPLC 檢測。

旋光度數據已借助於 Perkin Elmer 241 偏光計收集(化合物被溶解在 $CHCl_3$ 中，溫度以攝氏度給予；"c"表示以克/毫升表示之濃度，光徑長度為 10 公分)。

化合物 1.0C.(+)-化合物：

以固體的形式獲得 575 毫克的(+)-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[(1R,2S)-2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺(Chiralpak IB ®正庚烷/二氯甲烷 1：1；滯留時間：5.45 分鐘)；$[\alpha]^{23}_{D}$ = + 53.7(c 5.25，$CHCl_3$)。

$\triangle \rho_{min}$ =	-0.85 e Å^{-3}
$\triangle \rho_{max}$ =	1.30 e Å^{-3}
所使用之反射	3359
截斷：I >	3.00σ (I)
精製參數	227
S =	0.91
R-因子	0.064
加權 R-因子	0.141

$\triangle / \sigma_{max}$	0.0013
弗萊克參數	0.03(3)

a= 7.98250(10)Å		α = 90°	
b= 6.77940(10)Å		β = 96.7045(15)°	
c= 16.3176(2)Å		γ =90°	
體積	877.01(2) Å^3	晶體種類	單斜
空間群	P 1 2_1 1	Z=	2
式	$C_{16}H_{17}Cl_2F_2N_3O_2$	Mr	392.23

化合物 1.0D.(-)-化合物：

以固體的形式獲得 614 毫克的(-)-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[(1S,2R)-2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺(Chiralpak IB® 正庚烷/二氯甲烷 1：1；滯留時間：12.21 分鐘)；$[\alpha]^{23}_D$ = - 51.6(c 5.4，$CHCl_3$)。

x-射線數據

$\triangle \rho_{min}$ =	-0.80 e Å^{-3}
$\triangle \rho_{max}$ =	1.52 e Å^{-3}
所使用之反射	3605
截斷：I >	3.00σ (I)
精製參數	228
S =	0.94
R-因子	0.070
加權 R-因子	0.153
$\triangle / \sigma_{max}$	0.0018
弗萊克參數	0.01(3)

a= 7.97670(10) Å　　α = 90°

b= 6.78250(10) Å　　β = 96.7328(9)°

c= 16.320(2) Å　　γ =90°

體積　876.96(2) $Å^3$　晶體種類　單斜

空間群　P 1 2_1 1　Z=　2

式　$C_{16}H_{17}Cl_2F_2N_3O_2$　Mr　392.23

3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺的消旋主要非鏡像異構物B(同側)(1.25克，如實施例1a中所述製備)係在使用正庚烷/二氯甲烷1：1(體積/體積)作為溶析液之Chiralpak IB®(尺寸；250毫米x20毫米，粒度：5微米，流速：20毫升/分鐘)上借助於高效液相層析(HPLC)純化。為了整個物質之純化，在管柱上分開進行幾次操作。化合物之檢測係用UV檢測器於254奈米執行。純鏡像異構物樣品(ee > 99%)係藉由使用正庚烷/二氯甲烷 1：1(v/v)作為溶析液之分析型HPLC(Chiralpak IB®(尺寸：250毫米x4.6毫米，粒度：5微米，流速：1毫升/分鐘)借助於HPLC檢測。

旋光度數據已借助於Perkin Elmer 241偏光計收集(化合物被溶解在$CHCl_3$中，溫度以攝氏度給予；"c"表示以克/毫升表示之濃度，光徑長度為10公分)。

<u>化合物 1.0E.(-)-化合物：</u>

以固體的形式獲得 560 毫克的(-)-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[(1R,2R)-2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺。(Chiralpak IB® 正庚烷/二氯甲烷 1：1；滯

留時間：6.57 分鐘)；$[\alpha]^{23}_{D}$ = -166.5(c5.1，$CHCl_3$)。

化合物 1.0F.(+)-化合物：

以固體的形式獲得 590 毫克的(+)-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[(1S,2S)-2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺。(Chiralpak IB® 正庚烷/二氯甲烷 1：1；滯留時間：8.98 分鐘)；$[\alpha]^{23}_{D}$ = + 165.6(c 5.6，$CHCl_3$)。

對於生物例，式 I 之化合物使用於其消旋形式。

生物例

每當活性成分組合物之作用大於各個成分之作用的總和時，存在增效作用。

給定的活性成分組合物之預期作用 E 遵守所謂的 COLBY 公式且可計算如下(COLBY，S.R."計算除草劑組合物的增效及拮抗反應"，Weeds，第 15 冊，第 20-22 頁，1967 年)：ppm＝以每公升噴霧混合物計之活性成分(＝a.i.)毫克數

X＝使用 p ppm 活性成分的活性成分 A)之作用%

Y＝使用 q ppm 活性成分的活性成分 B)之作用%

根據 COLBY，使用 p＋q ppm 活性成分的活性成分 A)＋B)之預期(加成)作用為

$$E = X + Y - \frac{X \cdot Y}{100}$$

如果實際觀察的作用(O)大於預期效用(E)時，則組合物之作用為超加成，即為增效作用。在數學術語中，增效因子 SF 相當於 O/E。在農業操作中，SF ≥1.2 表示優於活性的純互

補加成(預期活性)之顯著改良，而在實際應用慣例中，SF ≤ 0.9 表示與預期活性比較之活性損失。

在孔板中之液體培養試驗：

將真菌之菌絲片段或分生孢子懸浮液，從真菌之液體培養基新鮮製備或來自低溫儲存，直接地混合於營養肉汁中。試驗化合物(最大 10 毫克/毫升)之 DMSO 溶液用 0.025 % Tween20 稀釋 50 倍及將 10 微升之此溶液吸移至微量滴定盤(96-孔格式)中。然後加入包含真菌孢子/菌絲體片段之營養肉汁以產生試驗化合物之終濃度。試驗板係在黑暗中於 24℃及 96% 相對濕度下培養。在 2-7 天之後目視測定真菌生長的抑制作用，視植物病害體系(pathosystem)而定，且計算相對於未經處理的檢測之抗真菌活性百分比。

實施例 B1：對抗富氏葡萄孢盤菌(Botryotinia fuckeliana)(灰黴菌)之殺真菌作用/液體培養基(灰黴病)

將來自低溫儲存之真菌的分生孢子直接地混合於營養肉汁(Vogels 肉汁)中。在將試驗化合物的(DMSO)溶液放進微量滴定盤(96-孔格式)之後，加入包含真菌孢子之營養肉汁。將試驗盤在 24℃下培養和在施用之後 3-4 天目視測定生長的抑制作用。結果給予於表 B1 中：

表 B1：

	ppm	ppm	% 作用
化合物 1.001	1.000		70
化合物 1.001	0.500		50
化合物 1.001	0.250		50

化合物 1.001	0.125		20	
化合物 1.001	0.063		20	
亞托敏		2.000	50	
亞托敏		1.000	50	
亞托敏		0.500	50	
亞托敏		0.250	20	
亞托敏		0.125	20	
亞托敏		0.063	0	Colby
4：1	1.000	0.250	90	76
4：1	0.500	0.125	70	60
2：1	1.000	0.500	100	85
2：1	0.500	0.250	90	60
2：1	0.250	0.125	70	60
2：1	0.125	0.063	50	20
1：1	1.000	1.000	100	85
1：1	0.500	0.500	100	75
1：1	0.250	0.250	70	60
1：1	0.125	0.125	50	36
1：2	1.000	2.000	100	85
1：2	0.500	1.000	100	75
1：2	0.250	0.500	90	75
1：2	0.125	0.250	50	36
1：4	0.500	2.000	100	75
1：4	0.250	1.000	100	75

1：4	0.125	0.500	70	60
1：4	0.063	0.250	50	36

實施例 B2：對抗終極腐黴菌(Pythium ultimum)之殺真菌作用/液體培養基(幼苗猝倒病)

將真菌之新鮮生長液體培養基的菌絲片段和卵孢子直接混合於營養肉汁(PDB 馬鈴薯葡萄糖肉汁)中。將試驗化合物的(DMSO)溶液放進微量滴定盤(96-孔格式)之後，加入包含真菌菌絲/孢子之營養肉汁。將試驗盤在 24℃下培養和在施用之後 2-3 天目視測定生長的抑制作用。結果給予於表 B2 中：

表 B2：

	ppm	ppm	%作用	
化合物 1.001	20.000		0	
化合物 1.001	10.000		0	
化合物 1.001	5.000		0	
化合物 1.001	2.500		0	
亞托敏		20.000	70	
亞托敏		10.000	50	Colby
1：1	20.000	20.000	90	70
1：1	10.000	10.000	70	50
1：2	5.000	10.000	70	50
1：4	5.000	20.000	90	70
1：4	2.500	10.000	70	50

實施例 B3：對抗油菜菌核病菌(Sclerotinia sclerotiorum)之

殺真菌作用/液體培養基(棉狀腐病)

將真菌之新鮮生長液體培養基的菌絲片段直接混合於營養肉汁(PDB 馬鈴薯葡萄糖肉汁)中。將試驗化合物的(DMSO)溶液放進微量滴定盤(96-孔格式)之後加入包含真菌物質之營養肉汁。將試驗盤在 24℃下培養和在施用之後3-4天目視測定生長的抑制作用。結果給予於表 B3 中：

表 B3：

	ppm	ppm	%作用	
化合物 1.001	1.250		70	
化合物 1.001	0.625		50	
化合物 1.001	0.313		20	
亞托敏		5.000	50	
亞托敏		2.500	20	
亞托敏		1.250	20	
亞托敏		0.625	0	Colby
1:4	1.250	5.000	100	85
1:2	1.250	2.500	100	76
1:1	1.250	1.250	90	76
1:4	0.625	2.500	90	60
1:2	0.625	1.250	90	60
1:4	0.313	1.250	70	36
1:2	0.313	0.625	70	20

實施例 B4：對抗花生球腔菌(Mycosphaerella arachidis)(落花生褐斑病菌(Cercospora arachidicola))之殺真菌作用/液

體培養基(早期葉斑病)

將來自低溫儲存之真菌的分生孢子直接地混合於營養肉汁(PDB 馬鈴薯葡萄糖肉汁)中。在將試驗化合物的(DMSO)溶液放進微量滴定盤(96-孔格式)之後，加入包含真菌孢子之營養肉汁。將試驗盤在 24℃下培養和在施用之後 4-5 天目視測定生長的抑制作用。結果給予於表 B4 中：

表 B4：

	ppm	ppm	%作用	
化合物 1.001	0.078		20	
化合物 1.001	0.039		0	
亞托敏		0.156	70	
亞托敏		0.078	50	
亞托敏		0.039	20	Colby
2：1	0.078	0.039	50	36
1：1	0.078	0.078	70	60
1：2	0.078	0.156	100	76
1：2	0.039	0.078	70	50
1：4	0.039	0.156	90	70

實施例 B5：對抗 Tapesia yallundae W-型(小麥基腐病菌)之殺真菌作用/液體培養基(眼斑病)

將來自低溫儲存之真菌的分生孢子直接地混合於營養肉汁(PDB 馬鈴薯葡萄糖肉汁)中。在將試驗化合物的(DMSO)溶液放進微量滴定盤(96-孔格式)之後，加入包含真菌孢子

之營養肉汁。將試驗盤在 24℃ 下培養和在施用之後 3-4 天目視測定生長的抑制作用。結果給予於表 B5 中：

表 B5：

	ppm	ppm	% 作用	
化合物 1.001	1.250		70	
化合物 1.001	0.625		50	
化合物 1.001	0.313		20	
化合物 1.001	0.156		0	
亞托敏		5.000	20	
亞托敏		2.500	20	
亞托敏		1.250	20	
亞托敏		0.625	20	
亞托敏		0.313	20	
亞托敏		0.156	0	
亞托敏		0.078	0	
1：4	1.250	5.000	100	76
1：2	1.250	2.500	100	76
1：1	1.250	1.250	100	76
2：1	1.250	0.625	100	76
4：1	1.250	0.313	100	76
1：4	0.625	2.500	100	60
1：2	0.625	1.250	100	60
1：1	0.625	0.625	100	60
2：1	0.625	0.313	90	60

4：1	0.625	0.156	70	50
1：4	0.313	1.250	100	36
1：2	0.313	0.625	90	36
1：1	0.313	0.313	70	36
2：1	0.313	0.156	50	20
4：1	0.313	0.078	50	20
1：4	0.156	0.625	70	20
1：2	0.156	0.313	50	20

實施例 B6：對抗禾生球腔菌(Mycosphaerella graminicola)(小麥殼針孢菌)之殺真菌作用/液體培養基(枯斑(Septoria blotch))：

將來自低溫儲存之真菌的分生孢子直接地混合於營養肉汁(PDB馬鈴薯葡萄糖肉汁)中。在將試驗化合物的(DMSO)溶液放進微量滴定盤(96-孔格式)之後，加入包含真菌孢子之營養肉汁。將試驗盤在24℃下培養和在施用之後4-5天目視測定生長的抑制作用。結果給予於表B6中：

表B6：

	ppm	ppm	%作用	
化合物 1.001	0.313		90	
化合物 1.001	0.156		70	
賽普洛		1.250	0	
賽普洛		0.625	0	
賽普洛		0.313	0	
賽普洛		0.156	0	Colby

1：1	0.156	0.156	90	70
1：2	0.156	0.313	90	70
1：4	0.313	1.250	100	90
1：4	0.156	0.625	90	70

實施例 B7：對抗 Tapesia yallundae W-型(小麥基腐病菌)之殺真菌作用/液體培養基(眼斑病)

將來自低溫儲存之真菌的分生孢子直接地混合於營養肉汁(PDB 馬鈴薯葡萄糖肉汁)中。在將試驗化合物的(DMSO)溶液放進微量滴定盤(96-孔格式)之後，加入包含真菌孢子之營養肉汁。將試驗盤在 24℃下培養和在施用之後 3-4 天目視測定生長的抑制作用。結果給予於表 B7 中：

表 B7：

	ppm	ppm	%作用
化合物 1.001	1.250		70
化合物 1.001	0.625		50
化合物 1.001	0.313		20
化合物 1.001	0.156		20
化合物 1.001	0.078		0
化合物 1.001	0.039		0
賽普洛		5.000	0
賽普洛		2.500	0
賽普洛		1.250	0
賽普洛		0.625	0
賽普洛		0.313	0

賽普洛		0.156	0	
賽普洛		0.078	0	
賽普洛		0.039	0	Colby
1：4	1.250	5.000	100	70
1：2	1.250	2.500	100	70
1：1	1.250	1.250	100	70
2：1	1.250	0.625	100	70
4：1	1.250	0.313	90	70
1：4	0.625	2.500	100	50
1：2	0.625	1.250	100	50
1：1	0.625	0.625	100	50
2：1	0.625	0.313	100	50
4：1	0.625	0.156	70	50
1：4	0.313	1.250	100	20
1：2	0.313	0.625	100	20
1：1	0.313	0.313	100	20
2：1	0.313	0.156	70	20
4：1	0.313	0.078	50	20
1：4	0.156	0.625	90	20
1：2	0.156	0.313	90	20
1：1	0.156	0.156	90	20
2：1	0.156	0.078	50	20
1：4	0.078	0.313	70	0
1：2	0.078	0.156	50	0

1：1	0.078	0.078	70	0
1：4	0.039	0.156	50	0
1：1	0.039	0.039	50	0

實施例 B8：對抗油菜菌核病菌(Sclerotinia sclerotiorum)之殺真菌作用/液體培養基(棉狀腐病)：

將真菌之新鮮生長液體培養基的菌絲片段直接混合於營養肉汁(PDB 馬鈴薯葡萄糖肉汁)中。將試驗化合物的(DMSO)溶液放進微量滴定盤(96-孔格式)之後加入包含真菌物質之營養肉汁。將試驗盤在 24℃下培養和在施用之後 3-4 天目視測定生長的抑制作用。結果給予於表 B8 中：

表 B8：

	ppm	ppm	%作用	
化合物 1.001	1.250		70	
化合物 1.001	0.625		50	
化合物 1.001	0.313		20	
化合物 1.001	0.156		0	
化合物 1.001	0.078		0	
四氯異苯腈		0.625	90	
四氯異苯腈		0.313	20	
四氯異苯腈		0.156	0	Colby
4：1	1.250	0.313	90	76
4：1	0.625	0.156	70	50
2：1	0.625	0.313	90	60
2：1	0.313	0.156	50	20

1：1	0.313	0.313	90	36
1：1	0.156	0.156	50	0
1：2	0.156	0.313	50	20
1：4	0.156	0.625	100	90
1：4	0.078	0.313	50	20

實施例 B9：對抗禾生球腔菌(小麥殼針孢菌)之殺真菌作用/液體培養基(枯斑)：

將來自低溫儲存之真菌的分生孢子直接地混合於營養肉汁(PDB 馬鈴薯葡萄糖肉汁)中。在將試驗化合物的(DMSO)溶液放進微量滴定盤(96-孔格式)之後，加入包含真菌孢子之營養肉汁。將試驗盤在 24℃下培養和在施用之後 4-5 天目視測定生長的抑制作用。結果給予於表 B9 中：

表 B9：

	ppm	ppm	%作用	
化合物 1.001	0.156		70	
化合物 1.001	0.078		20	
四氯異苯腈		0.156	50	
四氯異苯腈		0.078	20	Colby
2：1	0.156	0.078	90	76
1：1	0.078	0.078	50	36
1：2	0.078	0.156	90	60

實施例 B10：對抗 Tapesia yallundae W-型(小麥基腐病菌)之殺真菌作用/液體培養基((眼斑病)

將來自低溫儲存之真菌的分生孢子直接地混合於營養

肉汁(PDB 馬鈴薯葡萄糖肉汁)中。在將試驗化合物的(DMSO)溶液放進微量滴定盤(96-孔格式)之後，加入包含真菌孢子之營養肉汁。將試驗盤在 24℃下培養和在施用之後 3-4 天目視測定生長的抑制作用。結果給予於表 B10 中：

表 B10：

	ppm	ppm	%作用	
化合物 1.001	1.250		50	
化合物 1.001	0.625		20	
化合物 1.001	0.313		20	
化合物 1.001	0.156		0	
化合物 1.001	0.078		0	
四氯異苯腈		0.313	20	
四氯異苯腈		0.156	20	Colby
4：1	1.250	0.313	70	60
4：1	0.625	0.156	50	36
2：1	0.625	0.313	50	36
1：1	0.313	0.313	50	36
1：2	0.156	0.313	50	20
1：4	0.078	0.313	50	20

實施例 B11：對抗富氏葡萄孢盤菌(灰黴菌)之殺真菌作用/液體培養基(灰黴病)

將來自低溫儲存之真菌的分生孢子直接地混合於營養肉汁(Vogels 肉汁)中。在將試驗化合物的(DMSO)溶液放進微量滴定盤(96-孔格式)之後，加入包含真菌孢子之營養肉

汁。將試驗盤在 24℃下培養和在施用之後 3-4 天目視測定生長的抑制作用。結果給予於表 B11 中：

表 B11：

	ppm	ppm	%作用	
化合物 1.001	0.500		50	
化合物 1.001	0.250		20	
化合物 1.001	0.125		20	
化合物 1.001	0.063		0	
化合物 1.001	0.031		0	
護汰寧		0.125	70	
護汰寧		0.063	20	Colby
4：1	0.500	0.125	100	85
4：1	0.250	0.063	90	36
2：1	0.250	0.125	100	76
2：1	0.125	0.063	70	36
1：1	0.125	0.125	100	76
1：1	0.063	0.063	50	20
1：2	0.063	0.125	100	70
1：4	0.031	0.125	50	70

實施例 B12：對抗黃色鐮刀菌(Fusarium culmorum)之殺真菌作用/液體培養基(赤黴病)

將來自低溫儲存之真菌的分生孢子直接地混合於營養肉汁(PDB 馬鈴薯葡萄糖肉汁)中。在將試驗化合物的(DMSO)溶液放進微量滴定盤(96-孔格式)之後，加入包含真菌孢子

之營養肉汁。將試驗盤在 24℃下培養和在施用之後 3-4 天目視測定生長的抑制作用。結果給予於表 B12 中：

表 B12：

	ppm	ppm	%作用	
化合物 1.001	2.000		20	
化合物 1.001	1.000		0	
化合物 1.001	0.500		0	
化合物 1.001	0.250		0	
化合物 1.001	0.125		0	
化合物 1.001	0.063		0	
護汰寧		0.500	70	
護汰寧		0.250	20	Colby
4：1	2.000	0.500	90	76
4：1	1.000	0.250	70	20
2：1	1.000	0.500	90	70
2：1	0.500	0.250	50	20
1：1	0.500	0.500	90	70
1：1	0.250	0.250	50	20
1：2	0.125	0.250	50	20
1：4	0.063	0.250	50	20

實施例 B13：對抗禾生球腔菌(小麥殼針孢菌)之殺真菌作用/液體培養基(枯斑)：

將來自低溫儲存之真菌的分生孢子直接地混合於營養肉汁營養肉汁(PDB 馬鈴薯葡萄糖肉汁)中。在將試驗化合物

的(DMSO)溶液放進微量滴定盤(96-孔格式)之後，加入包含真菌孢子之營養肉汁。將試驗盤在 24℃下培養和在施用之後 4-5 天目視測定生長的抑制作用。結果給予於表 B13 中：

表 B13：

	ppm	ppm	%作用	
化合物 1.001	0.156		70	
化合物 1.001	0.078		20	
平克座		0.625	20	
平克座		0.313	0	
平克座		0.156	0	
平克座		0.078	0	Colby
1：1	0.156	0.156	90	70
1：1	0.078	0.078	70	20
1：2	0.156	0.313	100	70
1：2	0.078	0.156	70	20
1：4	0.156	0.625	90	76
1：4	0.078	0.313	70	20

實施例 B14：對抗 Tapesia yallundae W-型(小麥基腐病菌)之殺真菌作用/液體培養基((眼斑病)：

將來自低溫儲存之真菌的分生孢子直接地混合於營養肉汁(PDB 馬鈴薯葡萄糖肉汁)中。在將試驗化合物的(DMSO)溶液放進微量滴定盤(96-孔格式)之後，加入包含真菌孢子之營養肉汁。將試驗盤在 24℃下培養和在施用之後 3-4 天目視測定生長的抑制作用。結果給予於表 B14 中：

表 B14：

	ppm	ppm	%作用	
化合物 1.001	1.250		70	
化合物 1.001	0.625		50	
化合物 1.001	0.313		20	
化合物 1.001	0.156		20	
得克利		0.625	20	Colby
2：1	1.250	0.625	100	76
1：1	0.625	0.625	100	60
1：2	0.313	0.625	90	36
1：4	0.156	0.625	100	36

實施例 B15：對抗水稻紋枯病菌(Thanatephorus cucumeris)(立枯絲核菌)之殺真菌作用/液體培養基(根腐病，猝倒病)：

將真菌之新鮮生長液體培養基的菌絲片段直接混合於營養肉汁(PDB 馬鈴薯葡萄糖肉汁)中。將試驗化合物的(DMSO)溶液放進微量滴定盤(96-孔格式)之後，加入包含真菌物質之營養肉汁。將試驗盤在 24℃下培養和在施用之後 3-4 天目視測定生長的抑制作用。結果給予於表 B15 中：

表 B15：

	ppm	ppm	%作用
化合物 1.001	2.000		0
化合物 1.001	1.000		0
化合物 1.001	0.500		0
化合物 1.001	0.250		0

異吡唑		2.000	70	
異吡唑		1.000	70	
異吡唑		0.500	70	
異吡唑		0.250	70	
異吡唑		0.125	50	Colby
4：1	2.000	0.500	90	70
2：1	2.000	1.000	90	70
1：1	2.000	2.000	90	70
4：1	1.000	0.250	90	70
2：1	1.000	0.500	90	70
1：1	1.000	1.000	90	70
1：2	1.000	2.000	90	70
4：1	0.500	0.125	70	50
2：1	0.500	0.250	90	70
1：1	0.500	0.500	90	70
1：2	0.500	1.000	90	70
1：4	0.500	2.000	100	70
2：1	0.250	0.125	70	50
1：1	0.250	0.250	70	70
1：2	0.250	0.500	90	70
1：4	0.250	1.000	90	70

實施例 B16：對抗富氏葡萄孢盤菌(灰黴菌)之殺真菌作用/液體培養基(灰黴病)

將來自低溫儲存之真菌的分生孢子直接地混合於營養

肉汁(Vogels 肉汁)中。在將試驗化合物的(DMSO)溶液放進微量滴定盤(96-孔格式)之後，加入包含真菌孢子之營養肉汁。將試驗盤在 24℃下培養和在施用之後 3-4 天目視測定生長的抑制作用。結果給予於表 B16 中：

表 B16：

	ppm	ppm	%作用	
化合物 1.001	0.125		20	
化合物 1.001	0.063		20	
化合物 1.001	0.031		0	
化合物 1.001	0.016		0	
異吡劄		0.063	20	
異吡劄		0.031	20	Colby
4：1	0.125	0.031	50	36
2：1	0.125	0.063	50	36
1：1	0.063	0.063	50	36
1：2	0.031	0.063	50	20
1：4	0.016	0.063	50	20

實施例 B17：對抗禾生球腔菌(小麥殼針孢菌)之殺真菌作用/液體培養基(枯斑)：

將來自低溫儲存之真菌的分生孢子直接地混合於營養肉汁營養肉汁(PDB 馬鈴薯葡萄糖肉汁)中。在將試驗化合物的(DMSO)溶液放進微量滴定盤(96-孔格式)之後，加入包含真菌孢子之營養肉汁。將試驗盤在 24℃下培養和在施用之後 4-5 天目視測定生長的抑制作用。結果給予於表 B17 中：

表 B17：

	ppm	ppm	%作用	
化合物 1.001	0.125		50	
化合物 1.001	0.063		20	
化合物 1.001	0.031		0	
化合物 1.001	0.016		0	
異吡劄		0.125	70	
異吡劄		0.063	20	
異吡劄		0.031	0	Colby
4：1	0.125	0.031	70	50
2：1	0.125	0.063	90	60
2：1	0.063	0.031	50	20
1：1	0.063	0.063	70	36
1：2	0.063	0.125	90	76
1：2	0.031	0.063	50	20
1：4	0.016	0.063	20	20

在孔板中之葉圓片或葉片段試驗：

從在溫室生長的植物切割各種植物品種的葉圓片或葉片段。將切割葉圓片或片段放置在多孔板(24 孔格式)中之水瓊脂上。在接種之前(預防)或之後(治療)用試驗溶液噴灑葉圓片。製備欲試驗之化合物的 DMSO 溶液(最大 10 毫克/毫升)，其就在噴灑之前用 0.025% Tween 20 稀釋至適當濃度。在根據個別試驗系統之界定條件下(溫度、相對濕度、光、等等)培養接種之葉圓片或片段。在接種 3-9 天之後進

行疾病程度之單一評估，視植物病害體系(pathosystem)而定。然後計算相對於未經處理的檢測葉圓片或片段的百分比疾病控制。

實施例 B18 抗葡萄霜黴病菌(Plasmopara viticola)之殺真菌作用/葡萄/葉圓片預防性(晚疫病)：

將葡萄葉圓片放置在多孔板(24 孔格式)中之水瓊脂上且用稀釋於水中之調配試驗化合物噴霧。在施用 1 天之後用真菌之孢子懸浮液接種葉圓片。在 19℃和 80%相對濕度下於 12 小時光/12 小時黑暗之光方法下在氣候室中培養接種葉圓片且評估化合物之活性，其表示為當適當程度的疾病損害出現在未經處理的檢查葉圓片時(在施用 6-8 天之後)，與未經處理的檢測葉圓片比較的百分比疾病控制。結果給予於表 B18 中：

表 B18：

	ppm	ppm	%作用	
	10.00			
化合物 1.001	0		0	
化合物 1.001	5.000		7	
化合物 1.001	2.500		0	
化合物 1.001	1.250		0	
化合物 1.001	0.625		0	
雙炔醯菌胺		2.500	67	
雙炔醯菌胺		1.250	37	
雙炔醯菌胺		0.625	30	Colby

4：1	10	2.5	90	67
4：1	5	1.25	47	41
4：1	2.5	0.625	50	30
2：1	2.5	1.25	50	37
1：1	2.5	2.5	83	67
1：1	1.25	1.25	53	37
1：2	0.625	1.25	63	37

【圖式簡單說明】

無

【主要元件符號說明】

無

201002204

發明專利說明書

（本說明書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫）

※申請案號：98121940 A01P 43/56 (2006.01)

※申請日：98. 6 30 ※IPC 分類：C07D 413/04 (2006.01)

C07D 231/14

A01P 3/00 (2006.01)

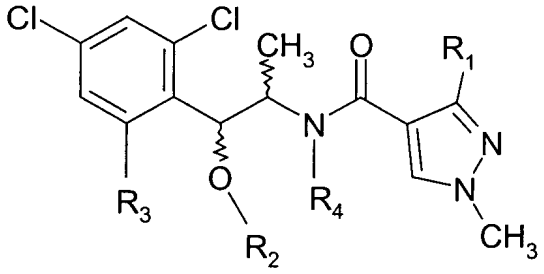
(2006.01)

一、發明名稱：（中文/英文）

殺真菌組成物 / Fungicidal Compositions

二、中文發明摘要：

一種控制有用植物或其繁殖物質上的植物病原性(phytopathogenic)疾病之方法，其包含將增效有效量的成分A)和 B)之組合物施用至有用植物、其所在地或其繁殖物質，其中成分 A)為一種式 I 的化合物



(I)，

其中

R_1 為 CF_2H 或 CF_3；

R_2 為甲基或乙基；

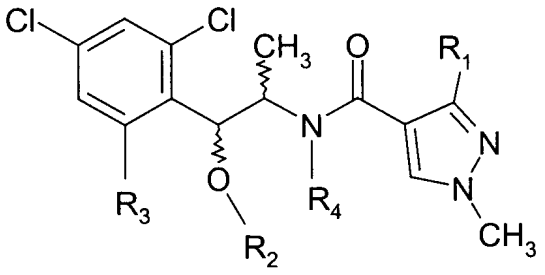
R_3 為氫或氯；及

R_4 為氫或環丙基；

及該等化合物之農藝上可接受的鹽類/異構物/鏡像異構物/互變異構物/N-氧化物；及成分 B)為一種選自已知其殺真菌及/或殺蟲活性之化合物的化合物，在控制或預防有用植物之真菌疾病是特別地有效的。

三、英文發明摘要：

A method of controlling phytopathogenic diseases on useful plants or on propagation material thereof, which comprises applying to the useful plants, the locus thereof or propagation material thereof a combination of components A) and B) in a synergistically effective amount, wherein component A) is a compound of formula I



(I),

wherein

R_1 is CF_2H or CF_3;

R_2 is methyl or ethyl;

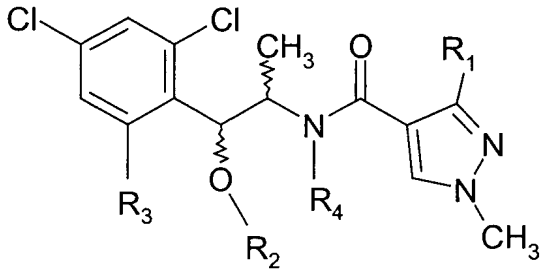
R_3 is hydrogen or chloro; and

R_4 is hydrogen or cyclopropyl;

and agronomically acceptable salts/isomers/enantiomers/tautomers/N-oxides of those compounds; and component B) is a compound selected from compounds known for their fungicidal and/or insecticidal activity, is particularly effective in controlling or preventing fungal diseases of useful plants.

七、申請專利範圍：

1.一種控制有用植物或其繁殖物質上的植物病原性疾病之方法，其包含將增效有效量的成分 A)和 B)之組合物施用至有用植物、其所在地或其繁殖物質，其中成分 A)為一種式 I 的化合物



(I)，

其中

R_1 為 CF_2H 或 CF_3；

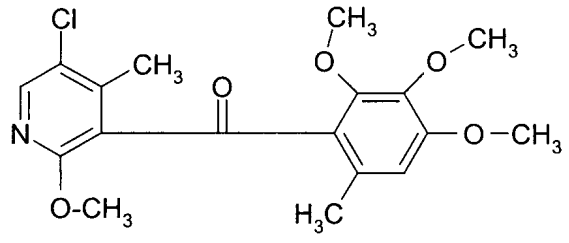
R_2 為甲基或乙基；

R_3 為氫或氟；及

R_4 為氫或環丙基；

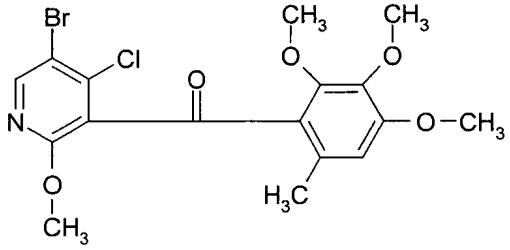
及該等化合物之農藝上可接受的鹽類/異構物/鏡像異構物/互變異構物/N-氧化物；及成分 B)為一種選自由下列所組成群組之化合物：亞托敏(azoxystrobin)、啶氧菌酯(picoxystrobin)、環克座(cyproconazole)、待克利(difenoconazole)、普克利(propiconazole)、護汰寧(fludioxonil)、賽普洛(cyprodinil)、芬必莫(fenpropimorph)、芬撲定(fenpropidin)、依普座(epoxiconazole)、依康唑(ipconazole)、雙炔醯菌胺(mandipropamid)、四氯異苯腈(chlorothalonil)、吲唑磺菌胺(amisulbrom)、比沙吩

(bixafen)、白克列(boscalid)、賽福滅(cyflufenamid)、待莫賓(dimoxystrobin)、烯肟菌酯(enestrobin)、噻唑菌胺(ethaboxam)、氟吡菌胺(fluopicolide)、氟吡菌醯胺(fluopyram)、氟沙賓(fluoxastrobin)、氟噻腈(fluthianil)、依康唑(ipconazole)、異噻菌胺(isotianil)、美芬酮(metrafenone)、肟醚菌胺(orysastrobin)、吡噻菌胺(penthiopyrad)、丙氧喹啉(proquinazid)、丙硫菌唑(prothioconazole)、百克敏(pyraclostrobin)、必立貝卡(pyribencarb)、瓦利非那(valiphenal)、異吡劑(isopyrazam)、1-甲基-環丙烯、平克座(penconazole)、得克利(tebuconazole)、三氟敏(trifloxystrobin)、硫、碳酸銅銨、油酸銅、福爾培(folpet)、奎諾斯芬(quinoxyfen)、鋅錳乃浦(mancozeb)、蓋普丹(captan)、芬海米(fenhexamid)、甲霜靈(mefenoxam)、腈硫醌(dithianon)、阿昔貝拉(acibenzolar)、固殺草(glufosinate)及其鹽類、嘉磷塞(glyphosate)及其鹽類、一種式II之化合物



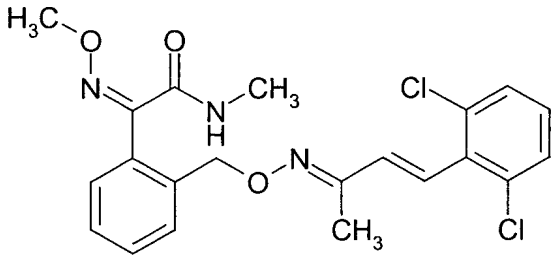
(II)，

一種式III之化合物



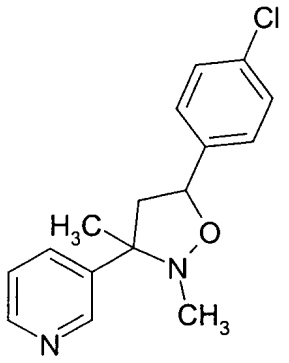
(III)，

一種式 IV 之化合物



(IV)，

及一種式 V 之化合物

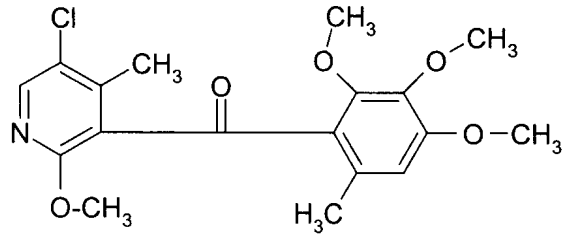


(V)

。

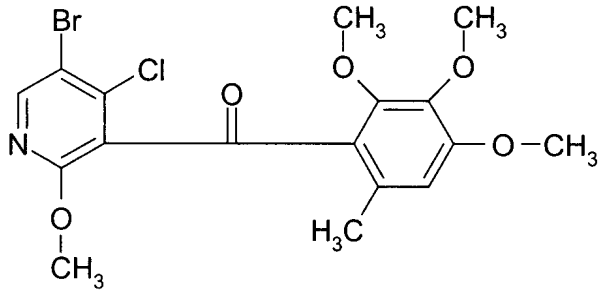
2.根據申請專利範圍第 1 項之方法，其中成分 B)為一種選自由下列所組成群組之化合物：亞托敏、啶氧菌酯、環克座、待克利、普克利、護汰寧、賽普洛、芬必莫、芬撲定、依普座、依康唑、雙炔醯菌胺、四氯異苯腈、吲唑磺菌胺、比沙吩、白克列、賽福滅、待莫賓、烯肟菌酯、噻唑菌胺、氟吡菌胺、氟吡菌醯胺、氟沙賓、氟噻腈、依康唑、異噻菌胺、美芬酮、肟醚菌胺、吡噻菌胺、丙氧喹

啉、丙硫菌唑、百克敏、必立貝卡、瓦利非那、一種式 II 之化合物



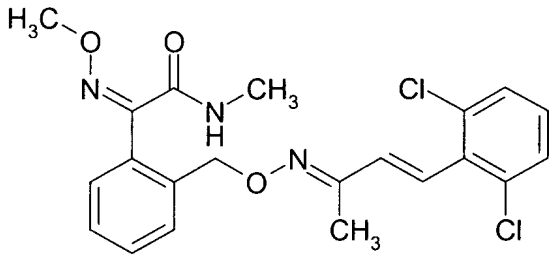
(II)，

一種式 III 之化合物



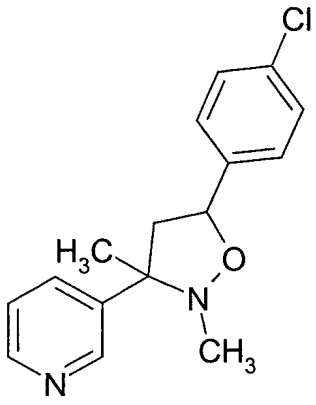
(III)，

一種式 IV 之化合物



(IV)，

及一種式 V 之化合物



(V)

3.根據申請專利範圍第 1 項之方法，其中成分 A)為 3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺及成分 B 為亞托敏。

4.根據申請專利範圍第 1 項之方法，其中成分 A)為 3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺及成分 B 為賽普洛。

5.根據申請專利範圍第 1 項之方法，其中成分 A)為 3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺及成分 B 為四氯異苯腈。

6.根據申請專利範圍第 1 項之方法，其中成分 A)為 3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺及成分 B 為護汰寧。

7.根據申請專利範圍第 1 項之方法，其中成分 A)為 3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺及成分 B 為平克座。

8.根據申請專利範圍第 1 項之方法，其中成分 A)為 3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧

基-1-甲基-乙基]-醯胺及成分B為得克利。

9.根據申請專利範圍第1項之方法，其中成分A)為3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺及成分B為異吡劄。

10.根據申請專利範圍第1項之方法，其中成分A)為3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺及成分B為雙炔醯菌胺。

11.一種殺真菌組成物，其包含增效有效量之根據申請專利範圍第1項的成分A)和B)之組合物。

12.一種保護取自然生命週期的植物及/或動物源的天然物質及/或其加工形式之方法，其包含將增效有效量之根據申請專利範圍第1項的成分A)與B)之組合物施用至該植物及/或動物源之天然物質或其加工形式。

八、圖式：

無

基-1-甲基-乙基]-醯胺及成分B為得克利。

9.根據申請專利範圍第1項之方法，其中成分A)為3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺及成分B為異吡劄。

10.根據申請專利範圍第1項之方法，其中成分A)為3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺及成分B為雙炔醯菌胺。

11.一種殺真菌組成物，其包含增效有效量之根據申請專利範圍第1項的成分A)和B)之組合物。

12.一種保護取自然生命週期的植物及/或動物源的天然物質及/或其加工形式之方法，其包含將增效有效量之根據申請專利範圍第1項的成分A)與B)之組合物施用至該植物及/或動物源之天然物質或其加工形式。

八、圖式：

無

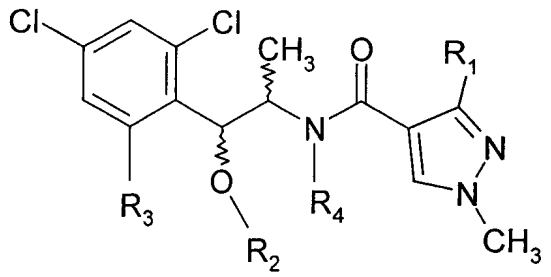
四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第（ 無 ）圖。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明:

無

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：



(I)