



(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 201306743 A1

(43)公開日：中華民國 102 (2013) 年 02 月 16 日

(21)申請案號：100146805

(22)申請日：中華民國 100 (2011) 年 12 月 16 日

(51)Int. Cl.：

A01N37/18 (2006.01)

A01N37/20 (2006.01)

C07C233/65 (2006.01)

C07C233/69 (2006.01)

A01N25/04 (2006.01)

A01P17/00 (2006.01)

(30)優先權：2011/01/24 英國

1101209.3

(71)申請人：先正達有限公司 (英國) SYNGENTA LIMITED (GB)

英國

(72)發明人：貝爾 高登 BELL, GORDON ALISTAIR (GB)；沛瑞 理察 PERRY, RICHARD BRIAN (GB)；瑞薩 茱莉亞 RAMSAY, JULIA LYNNE (GB)；史塔克 大衛 STOCK, DAVID (GB)；泰勒 菲力浦 TAYLOR, PHILIP (GB)

(74)代理人：林志剛

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：21 項 圖式數：0 共 47 頁

(54)名稱

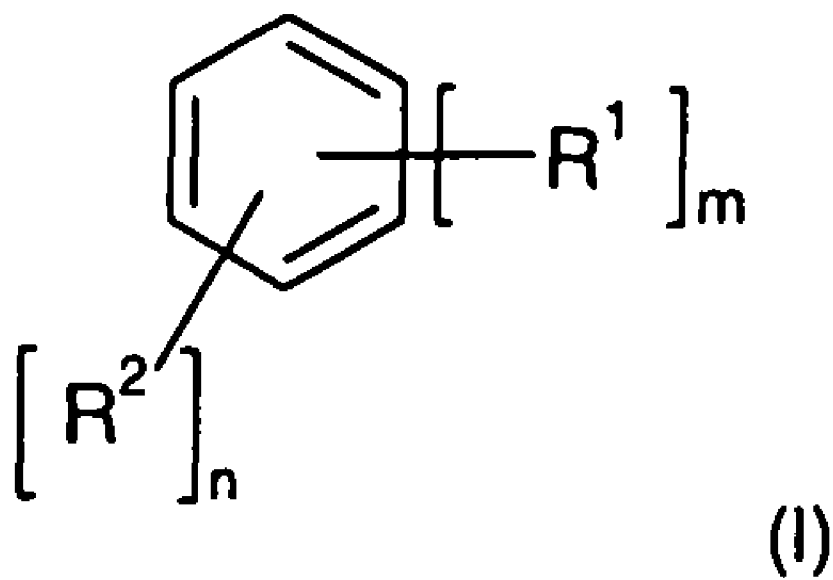
調合物組分

FORMULATION COMPONENT

(57)摘要

本發明是關於含有某些苯甲醯胺化合物的農用化學組成物及這些苯甲醯胺化合物作為佐劑之用途，尤其是用於調合物中，特別是用於農用化學調合物中及對環境友善的調合物中。本發明進一步延伸至某些新穎苯甲醯胺化合物，與用以製備此類新穎化合物的方法。

式 (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 201306743 A1

(43)公開日：中華民國 102 (2013) 年 02 月 16 日

(21)申請案號：100146805

(22)申請日：中華民國 100 (2011) 年 12 月 16 日

(51)Int. Cl.：

A01N37/18 (2006.01)

A01N37/20 (2006.01)

C07C233/65 (2006.01)

C07C233/69 (2006.01)

A01N25/04 (2006.01)

A01P17/00 (2006.01)

(30)優先權：2011/01/24 英國

1101209.3

(71)申請人：先正達有限公司 (英國) SYNGENTA LIMITED (GB)

英國

(72)發明人：貝爾 高登 BELL, GORDON ALISTAIR (GB)；沛瑞 理察 PERRY, RICHARD BRIAN (GB)；瑞薩 茱莉亞 RAMSAY, JULIA LYNNE (GB)；史塔克 大衛 STOCK, DAVID (GB)；泰勒 菲利浦 TAYLOR, PHILIP (GB)

(74)代理人：林志剛

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：21 項 圖式數：0 共 47 頁

(54)名稱

調合物組分

FORMULATION COMPONENT

(57)摘要

本發明是關於含有某些苯甲醯胺化合物的農用化學組成物及這些苯甲醯胺化合物作為佐劑之用途，尤其是用於調合物中，特別是用於農用化學調合物中及對環境友善的調合物中。本發明進一步延伸至某些新穎苯甲醯胺化合物，與用以製備此類新穎化合物的方法。

發明專利說明書

(本申請書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：100146805

※申請日：100 年 12 月 16 日

※IPC 分類：

A01N 37/18 (2006.01)
A01N 37/20 (2006.01)
C07C 233/65 (2006.01)
C07C 233/69 (2006.01)
A01N 25/04 (2006.01)
A01P 17/00 (2006.01)

一、發明名稱：(中文／英文)

調合物組分

Formulation component

二、中文發明摘要：

本發明是關於含有某些苯甲醯胺化合物的農用化學組成物及這些苯甲醯胺化合物作為佐劑之用途，尤其是用於調合物中，特別是用於農用化學調合物中及對環境友善的調合物中。本發明進一步延伸至某些新穎苯甲醯胺化合物，與用以製備此類新穎化合物的方法。

三、英文發明摘要：

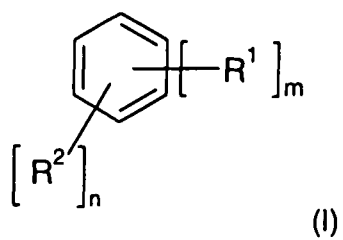
The present invention relates to agrochemical compositions comprising certain benzamide compounds and to the use of those benzamide compounds as adjuvants, especially in formulations, in particular in agrochemical formulations and in environmentally friendly formulations. The invention further extends to certain novel benzamide compounds and a process to prepare such novel compounds.

四、指定代表圖：

(一) 本案指定代表圖為：無

(二) 本代表圖之元件代表符號簡單說明：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：式(I)



六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明是關於含有某些苯甲醯胺化合物的農用化學組成物及這些苯甲醯胺化合物作為佐劑之用途，尤其是用於調合物中，特別是用於農用化學調合物中及對環境友善的調合物中。本發明進一步延伸至某些新穎苯甲醯胺化合物。

【先前技術】

農用化學組成物裡面的活性成分（AI）功效，通常能藉由加入更多的成分來改善。成分結合後所觀察到的功效有時候會比原本預期從使用的個別成分所獲得的功效明顯高出許多（協同作用）。基本上，佐劑是一種能夠增加AI生物活性然而本身並沒有顯著生物活性的物質。佐劑通常是界面活性劑，並且能夠納入調合物中或是另外加入藉由將其納入乳液濃縮調合物中，或是做為槽混劑添加劑（tank mix additive）。

除了對於生物活性的影響外，佐劑的物理性質也極為重要，因此於選擇時必須著眼於和調合物的相容性。例如，通常將固體佐劑摻進固體調合物（如水溶性或水可分散的顆粒）中會比較容易。一般來說，佐劑仰賴界面活性劑性質來強化生物活性，而一種典型的佐劑包含烷基或芳基以提供親脂性部分和（聚）乙氧基鏈以提供親水性部分。目前有許多有關針對各種目的選擇佐劑的資料，如 Hess,

F.D.與 Foy C.L.的 Weedtechnology, 2000, 14, 807-813。

本發明係奠基於一項發現，即某些苯甲醯胺化合物（特別是含有烷基及/或烷氧化鏈者）是出人意料十分有效的佐劑，可顯著強化活性成分的生物活性，尤其是農用化學品的生物活性。

EP0044955 對於以 pyridazone 衍生物及溶於酸醯胺之雙胺基甲酸酯的混合物為基礎的液態除草組成物提供說明。這些液態組成物的穩定度據說已有改善：酸醯胺的水溶性低，因此使活性成分結晶出來的傾向最小化，而且雙胺基甲酸酯在溶液中的穩定度很好。

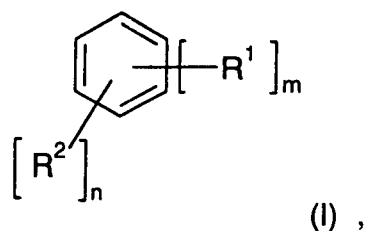
WO2011/010082 說明某些苯甲醯胺作為溶劑的用途（特別是對於農用化學品而言）。

WO2006/127399 說明包含活性成分氰氟蟲腓（metaflumizone）、選擇性使用之橋接劑、界面活性劑和合適的載體溶劑的高載量濃縮組成物。其中提及 N,N-二乙基間甲苯甲醯胺為合適的載體溶劑。

上述的先前技術皆未說明將本文中所述的式（I）化合物用作佐劑的用途，特別是用作農用化學品的生物功效佐劑，也就是作為能增進農用化學品生物功效的化合物。

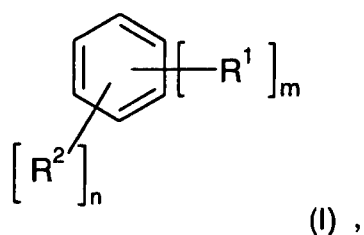
【發明內容】

第一方面，本發明提供將式（I）化合物用作佐劑的用途



其中 m 為 1、2 或 3 的整數； n 為 0、1、2 或 3 的整數； R^1 為 $C(O)NR^3R^4$ ；各個 R^2 係獨立為 C_{1-15} 烷基，各個 R^3 係獨立為 H 或 C_{1-6} 烷基，各個 R^4 係獨立為 C_{1-8} 烷基，基團 $-[AO]_x-R^5$ ，其中 x 為 0 至 20 的整數，各個 A 係獨立為 C_{1-4} 烷基，而各個 R^5 係獨立為 H、 C_{1-4} 烷基或 NH_2 。

式 (I) 的某些化合物為新穎的，因而構成本發明其他方面。因此本發明亦提供式 (I) 化合物



其中 m 為 1、2 或 3 的整數； n 為 0、1、2 或 3 的整數； R^1 為 $C(O)NR^3R^4$ ；各個 R^2 係獨立為 C_{1-15} 烷基，各個 R^3 係獨立為 H 或 C_{1-6} 烷基，各個 R^4 係獨立為 C_{1-8} 烷基，基團 $-[AO]_x-R^5$ ，其中 x 為 0 至 20 的整數，各個 A 係獨立為 C_{1-4} 烷基，而各個 R^5 係獨立為 H、 C_{1-4} 烷基或 NH_2 ；但當 m 為 1 且 n 為 1 時：(i) 當 R^2 為間位的甲基時，則當 R^4 為乙基時 R^3 不為乙基，而當 R^4 為甲基時 R^3 不為甲基；(ii) 當 R^2 為鄰位的甲基時，則：當 R^4 為丙基或三級丁

基時 R^3 不為甲基，當 R^4 為乙基、正丙基或正丁基時 R^3 不為正丙基，當 R^4 為甲基、乙基或正丁基時 R^3 不為正丁基，當 R^4 為異丁基時 R^3 不為異丁基，當 R^3 為 H、丙基、三級丁基或正戊基時 R^4 不為甲基，當 R^3 為乙基時 R^4 不為正丙基，當 R^3 為乙基時 R^4 不為正丁基，當 R^3 為 H 或甲基時 R^4 不為戊基，當 R^3 為 H 或甲基時 R^4 不為 2-乙基己基；以及 (iii) 當 R^2 為對位的甲基或鄰位的乙基時， R^3 與 R^4 不能兩者皆為甲基。

另一方面，本發明提供如同上文所定義、其中至少一個 R^4 為基團 $-[AO]_xR^5$ 的式 (I) 化合物，以及如同上文所定義、其中至少一個 R^2 處於對位的式 (I) 化合物。

又另一方面，本發明提供 (a) 一種含有如同上文所定義的新穎式 (I) 化合物結合農用化學品的農用化學組成物；(b) 一種製造含有結合新穎式 (I) 化合物與該農用化學品的農用化學組成物的方法；以及 (c) 本發明農用化學組成物於防治有害生物 (pest) 之用途。

烷基基團與部分為直鏈或支鏈，且除非有具體的相反聲明，否則為未經取代。烷基的例子為甲基、乙基、丙基、丁基、戊基、己基、庚基、辛基、壬基、癸基、十一烷基、十二烷基、十三烷基、十四烷基與十五烷基。

在本發明的特佳實施態樣中，較佳的 m 、 n 與 x 值，和較佳的 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 與 A 基團，在其任何組合中係如以下所示。

如以上所述， m 的值被陳述為 1、2 或 3。此外， n 的

值也被陳述為 1、2 或 3。在一組實施態樣之中， n 與 m 的數值總和將等於或大於 3，也就是這涵蓋 m 為 1 而 n 為 2 或 3 的式 (I) 化合物，以及 n 為 1 而 m 為 2 或 3 的式 (I) 化合物。

在某些實施態樣中， m 為 1 或 2，更佳的為 1。在某些實施態樣中， n 為 0、1 或 2，更佳的為 1。在進一步的實施態樣中， n 和 m 都是 1。在更進一步的實施態樣中， n 為 0 而 m 為 1。在至少一個 R^4 基團為 $-[AO]_xR^5$ 的實施態樣中，較佳的是 n 為 0 或 1。在 m 為 1 而 R^4 不是 $-[AO]_xR^5$ 的實施態樣中，較佳的是 n 為 1。

以上將 R^2 定義為基團 C_{1-15} 烷基，而其中當 n 大於 1 時，各個 R^2 基團係如此獨立定義。

較佳的是，各個 R^2 基團係獨立為 C_{1-12} 烷基，而在特佳的實施態樣中，各個 R^2 係獨立為甲基或 C_{6-12} 烷基，更佳的為甲基或直鏈 C_{6-12} 烷基，又更佳的為甲基、己基、辛基、癸基或十二烷基，而最佳的為甲基或十二烷基。

在更佳的實施態樣中，有至少一個 R^2 基團存在於對位。

當 n 為 1 時， R^2 可如同上述所定義，然而在一些實施態樣中，較佳的是當 R^2 處於鄰位或對位時，其為 C_{2-12} 烷基，更佳的為 C_{6-12} 烷基，又更佳的為直鏈 C_{6-12} 烷基，最佳的為己基、辛基、癸基或十二烷基。

R^1 在此定義為基團 $C(O)NR^3R^4$ ，其中各個 R^3 係獨立為 H 或 C_{1-6} 烷基，而各個 R^4 係獨立為 C_{1-8} 烷基或基團 -

$[AO]_xR^5$ ，其中 x 為 0 至 20 的整數，各個 A 係獨立為 C_{1-4} 烷基，而各個 R^5 係獨立為 H 、 C_{1-4} 烷基或 NH_2 。

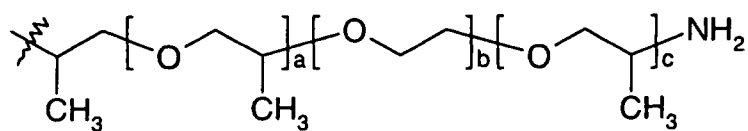
較佳的是在至少一個 R^1 基團中， R^3 為選自由 H 、甲基、乙基、丙基及丁基所組成的群組；更佳的為 H 、甲基、乙基、正丙基、正丁基或異丁基，而又更佳的為 H 或乙基，最佳的為 H 。

較佳的是在至少一個 R^1 基團中， R^4 為選自由 C_{2-8} 烷基以及基團 $-[AO]_xR^5$ （其中 A 、 x 與 R^5 皆如上述所定義）所組成之群組。在更佳的實施態樣中， x 為 1 或更大的值，較佳為 2 或更大的值，更佳為 2、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、18 或 19。

嫻熟相關技術的人將會明瞭，由於 x 的值可以至高達 20，而且各個 A 可獨立為甲基、乙基、丙基或丁基，因此次結構 $-[AO]_x-$ 可含有甲氧基、乙氧基、丙氧基及 / 或丁氧基單元於任何組合中至高達十三聚體，並且包括長度至多 20 個單元的聚甲氧鏈、聚乙氧鏈、聚丙氧鏈與聚丁氧鏈。

較佳的是有至少一個 A 基團為乙基或丙基。在一組較佳的實施態樣中， x 為 7-18（包括 7 和 18）的整數，而在特佳的一組實施態樣中， x 為 7-18（包括 7 和 18）的整數，而各個 A 基團為乙基。

另一組較佳的實施態樣中， A 為乙基， x 為 7 或 8，而 R^5 為 NH_2 。在另一組較佳的實施態樣中， R^4 為以下基團：



其中的「a」、「b」與「c」為整數，而「a」、「b」與「c」的總和等同於上文定義的 x 值。在特佳的實施態樣中，「b」的值為 9，而「a」與「c」的總和為約 3 或 4。

如上所述，各個 R^5 係獨立選自由 H、 C_{1-4} 烷基與 NH_2 所組成的群組。有關特定實施態樣，除非文中另有指明，否則較佳的是， R^5 為選自由 H、乙基、丙基及 NH_2 所組成之群組；更佳的是 R^5 為 H 或 NH_2 。

在本發明中作為佐劑使用的化合物的例子係提供於以下表 1 中，該表亦顯示所選擇的 1H NMR (400MHz) 資料，這些資料皆以 $CDCl_3$ 為溶劑所取得。本說明使用以下縮寫：

“NMR”=核磁共振光譜。

s=單峰

br=: 寬峰

d=雙峰

dd=: 雙重雙峰

(doublet of doublets)

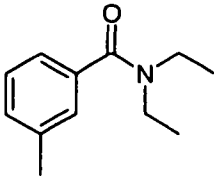
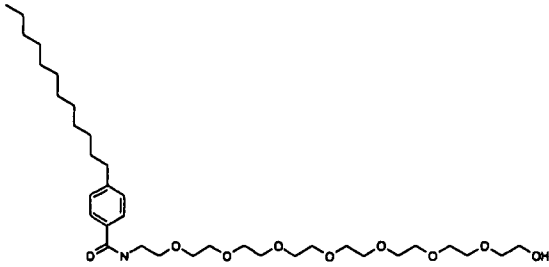
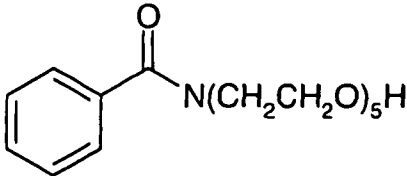
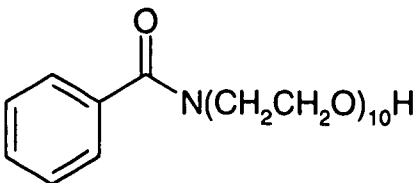
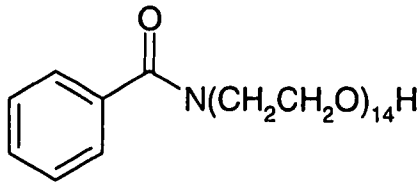
t=參峰

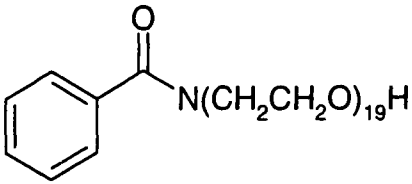
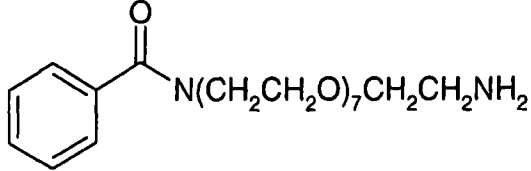
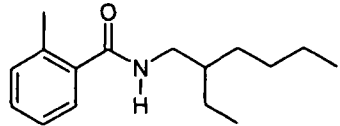
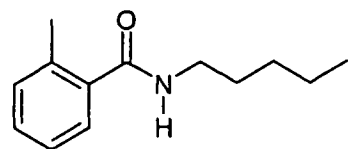
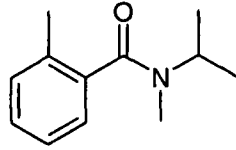
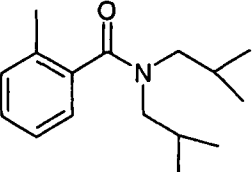
q=: 肆峰

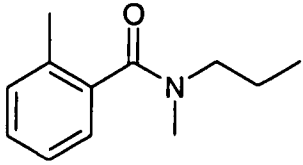
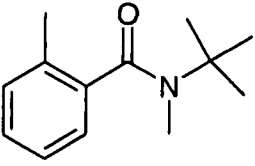
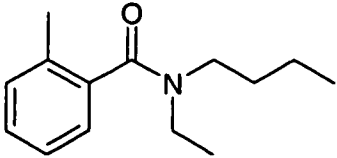
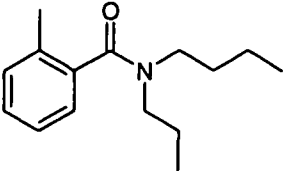
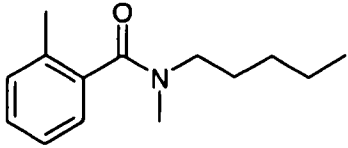
m=多峰

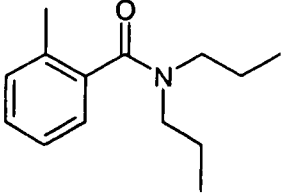
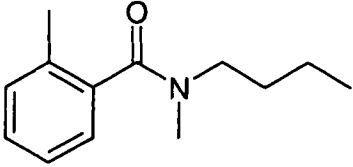
ppm: =每百萬份之份數

表 1：用於本發明的佐劑(N/A 代表在特性資料方面並未取得資料)

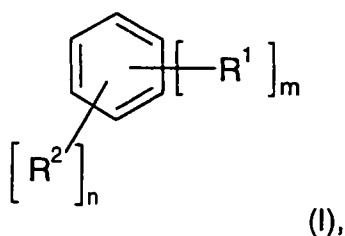
化合物 編號	結構	¹ H-NMR 資料: (ppm/H 數目/多重性)
1		N/A
2		N/A
3		N/A
4		N/A
5		N/A

6		N/A
7		N/A
8		7.35-7.15(4H,m);5.70(1H,br); 3.40(2H,m);2.45(3H,s); 1.55(1H,m);1.40(2H,m); 1.35-1.25(6H,m); 1.00-0.90(6H,m)。
9		7.35-7.25(2H,m); 7.20-7.15(2H,m); 5.80(1H,br);3.40(2H,m); 2.45(3H,s);1.60(2H,m); 1.35(4H,m);0.95(3H,t)。
10		(因為旋轉受限,而具複雜性) 7.30-7.10(4H,m); 5.05&3.75(1H,2m); 3.00&2.65(3H,2s);2.30(3H,2s); 1.15&1.10(6H、d 與 m)。
11		7.30-7.15(4H,m); 3.60-3.20(2H,br); 3.10-2.85(2H,br);2.30(3H,s); 2.15(1H,m);1.85(1H,m); 1.00(6H,d);0.75(6H,d)。

12		(因為旋轉受限,而具複雜性) 7.30-7.10(4H,m); 3.55 與 3.05(2H、br 和 t); 3.10 與 2.80(3H,2s); 2.30(3H,2s); 1.70 與 1.50(2H,2m); 1.00 與 0.75(3H,2t)。
13		7.25-7.10(4H,m); 2.75(3H,s); 2.30(3H,s);1.55(9H,s)。
14		(因為旋轉受限,而具複雜性) 7.30-7.15(4H,m); 3.80-3.20(2H,br); 3.15 與 3.05(2H,2m); 2.30(3H,2s);1.70、1.45 與 1.10(4H,3m);1.25、1.05、 1.00 與 0.75(6H,4t)。
15		(因為旋轉受限,而具複雜性) 7.30-7.10(4H,m); 3.80-3.10(2H,br);3.05(2H,m); 2.30(3H,s);1.70、1.45 與 1.10(6H,3m);1.00(3H,m); 0.75(3H,m)。
16		(因為旋轉受限,而具複雜性) 7.30-7.15(4H,m); 3.55 與 3.10(2H、br 和 t); 3.10 與 2.80(3H,2s); 2.30(3H,s);1.70、1.50、 1.40-1.35、1.20 與 1.10(6H,5m); 0.95 與 0.80(3H,2t)。

17		7.30-7.15(4H,m); 3.80-3.20(2H,br);3.00(2H,br); 2.30(3H,s);1.70(2H,m); 1.50(2H,m);1.00(3H,t); 0.75(3H,t)。
18		(因為旋轉受限,而具複雜性) 7.30-7.10(4H,m); 3.55 與 3.10(2H,br 與 t); 3.10 與 2.80(3H,2s); 2.30(3H,s);1.65、 1.50-1.40 與 1.15(4H,3m); 1.00 與 0.80(3H,2t)。

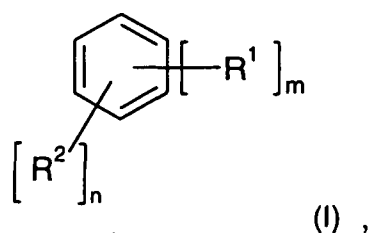
如上所述，式（I）的某些化合物為新穎。此種新穎化合物中有一組是 m 與 n 的總和為 3 或更大值者。亦屬新穎者為式（I）



之中 m 為 1、2 或 3 的整數；n 為 1、2 或 3 的整數；R¹ 為 C(O)NR³R⁴；各個 R² 係獨立為 C₁₋₁₅ 烷基，各個 R³ 係獨立為 H 或 C₁₋₆ 烷基，各個 R⁴ 係獨立為 C₁₋₈ 烷基，或是基團-[AO]_x-R⁵，其中 x 為 0 至 12 的整數，各個 A 係獨立為 C₁₋₄ 烷基，而各個 R⁵ 係獨立為 C₁₋₄ 烷基，或 NH₂；但當 m 為 1 且 n 為 1 時：（i）當 R² 為間位的甲基時，則當 R⁴ 為乙基時 R³ 不為乙基，而當 R⁴ 為甲基時 R³ 不為甲基；（ii

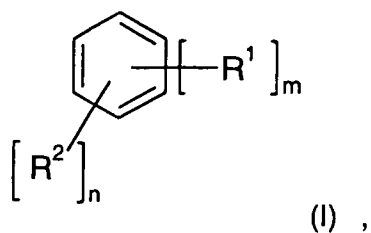
）當 R^2 為鄰位的甲基時，則：當 R^4 為丙基或三級丁基時 R^3 不為甲基，當 R^4 為乙基、正丙基或正丁基時 R^3 不為正丙基，當 R^4 為甲基、乙基或正丁基時 R^3 不為正丁基，當 R^4 為異丁基時 R^3 不為異丁基，當 R^3 為 H、丙基、三級丁基或正戊基時 R^4 不為甲基，當 R^3 為乙基時 R^4 不為正丙基，當 R^3 為乙基時 R^4 不為正丁基，當 R^3 為 H 或甲基時 R^4 不為戊基，當 R^3 為 H 或甲基時 R^4 不為 2-乙基-己基；以及 (iii) 當 R^2 為對位的甲基或鄰位的乙基時 R^3 與 R^4 不能兩者皆為甲基的化合物。

亦屬新穎者為式 (I)



之中 m 為 1、2 或 3 的整數； n 為 0、1、2 或 3 的整數； R^1 為 $C(O)NR^3R^4$ ；各個 R^2 係獨立為 C_{1-15} 烷基，各個 R^3 係獨立為 H 或 C_{1-6} 烷基，各個 R^4 係獨立為 C_{1-8} 烷基，或是基團 $-[AO]_x-R^5$ ，其中 x 為 0 至 20 的整數，各個 A 係獨立為 C_{1-4} 烷基，而各個 R^5 係獨立為 H、 C_{1-4} 烷基或 NH_2 ，但至少一個 R^4 為基團 $-[AO]_x-R^5$ 的化合物。

亦屬新穎者為式 (I)



之中 m 為 1、2 或 3 的整數； n 為 0、1、2 或 3 的整數； R^1 為 $C(O)NR^3R^4$ ；各個 R^2 係獨立為 C_{1-15} 烷基，各個 R^3 係獨立為 H 或 C_{1-6} 烷基，各個 R^4 係獨立為 C_{1-8} 烷基或基團 $-[AO]_x-R^5$ （其中 x 為 0 至 20 的整數，各個 A 係獨立為 C_{1-4} 烷基，而各個 R^5 係獨立為 H、 C_{1-4} 烷基或 NH_2 ），但至少一個 R^2 基團處於對位的化合物。

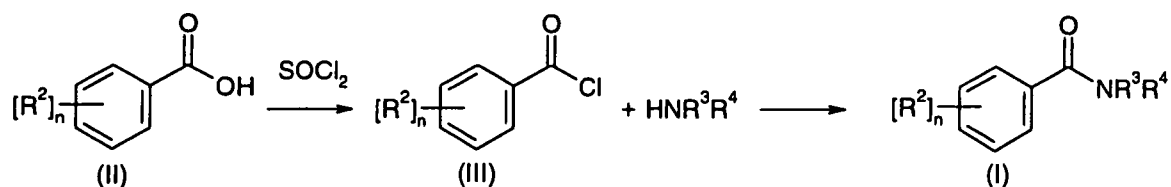
對於本發明的化合物，整數 m 、 n 與 x 以及取代基 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 與 A 的較佳情況係如同上文所述。

上文所定義的式 (I) 化合物可在市面上取得（例如化合物 1（*N,N*-二乙基-3-甲基苯甲醯胺或 *N,N*-二乙基間甲苯甲醯胺，可從美國 Alfa Aesar 或英國 Carbone Scientific 公司取得）），或是採用此技術領域中已知的例行技術從易於取得的起始原料來合成（有關化合物 1，可參閱例如 Wang, B. J-S., 1974 J. Chem. Ed. 51(10) : 631），或如以下以及實施例中所述。

【實施方式】

一般來說，可依據以下的反應圖解 1 來製備式 (I) 化合物：

反應圖解 1



可使用例如亞硫醯氯，將式 (II) 苯甲酸衍生物（其中 R^2 與 n 皆如文中所定義）轉換為式 (III) 醯氯。此醯氯能夠與一級胺或二級胺（其中 R^3 與 R^4 皆如文中所定義）反應，以形成所選的芳族醯胺。嫻熟相關技術的人將會明瞭，聚乙烯或是其他的多烷基-或混合的多烷基-、單元-或二元-胺可作為該胺來使用。式 (II) 化合物與合適的胺類容易取得，或可利用嫻熟相關技術的人所熟悉的例行技術來合成。

如先前所說明，本發明是以一項意外的發現為根據，即式 (I) 化合物是特別良好的佐劑，特別是用於農用化學調合物，而式 (I) 化合物所表現出的特殊佐助特徵為其增進生物功效的能力。因此，此類佐劑能夠與活性成分（其為農用化學品）組合，以形成農用化學組成物。本發明延伸至此類農用化學組成物以及製造此類農用化學組成物的方法，其中該方法包括將式 (I) 化合物與農用化學品組合。文中所使用的「農用化學品」一詞涵蓋除草劑、殺蟲劑、殺線蟲劑、殺軟體動物劑（molluscicide）、殺真菌劑、植物生長調節劑及安全劑。如文中所示，式 (I) 化合物在除草組成物中作為佐劑特別有效。

文中所使用的佐劑一詞，是指能夠增進活性成分（特別是農用化學品）之生物活性的化合物。因此，含有佐劑和活性成分的組成物其生物活性將比沒有佐劑的活性成分的生物活性大。此可藉由以下方式證實：直接對含有農用化學品及本發明佐劑的組成物和沒有該佐劑的農用化學品進行生物活性的比較。或者，也能藉由以下方式證實：對含有農用化學品及本發明佐劑的組成物和與已知佐劑組合的該農用化學品進行生物活性的比較。在某些情況中，所觀察到根據本發明的成分組合的功效，有時顯著高於從所用個別成分所預期的功效（亦即可觀察到協合作用）。

合適的除草劑包括雙環哌啶(bicyclopyrone)、硝磺草酮(mesotrione)、氟磺胺草醚(fomesafen)、三甲苯草酮(tralkoxydim)、敵草胺(napropamide)、雙甲脒(amitraz)、敵稗(propanil)、嘧黴胺(pyrimethanil)、氯硝胺(dicloran)、四氯硝基苯(tecnazene)、甲基立枯磷(toclofosmethyl)、麥草氟酯(flampropM)、2,4-D、MCPA、2-甲基-4-氯苯氧基丙酸(mecoprop)、炔草酯(clodinafop-propargyl)、氰氟草酯(cyhalofop-butyl)、禾草靈(diclofop methyl)、吡氟氯禾靈(haloxifop)、精喹禾靈-P(quizalofop-P)、吲哚-3-基乙酸(indol-3-ylacetic acid)、1-萘乙酸(1-naphthylacetic acid)、異惡噻草胺(isoxaben)、牧草胺(tebutam)、二甲基敵草索(chlorthal dimethyl)、苯菌靈(benomyl)、呋草黃(benfuresate)、麥草畏(dicamba)、敵草腈(dichlobenil)、草除靈(benazolin)、咪唑嗪(triazoxide)、氟佐隆

(fluazuron) 、 伏 蟲 隆 (teflubenzuron) 、 苯 敵 草 (phenmedipham) 、 乙 草 胺 (acetochlor) 、 甲 草 胺 (alachlor) 、 異 丙 甲 草 胺 (metolachlor) 、 丙 草 胺 (pretilachlor) 、 甲 氧 噠 草 胺 (thenylchlor) 、 亞 汰 草 (alloxydim) 、 丁 氧 環 酮 (butoxydim) 、 烯 草 酮 (clethodim) 、 賽 克 羅 定 (cyclodim) 、 稀 禾 定 (sethoxydim) 、 吡 喃 草 酮 (tepraloxym) 、 二 甲 戊 樂 靈 (pendimethalin) 、 特 樂 酚 (dinoterb) 、 甲 羧 除 草 醚 (bifenox) 、 氟 硝 草 醚 (oxyfluorfen) 、 三 氟 羧 草 醚 (acifluorfen) 、 乙 羧 氟 草 醚 (fluoroglycofen-ethyl) 、 溴 苯 腈 (bromoxynil) 、 碘 苯 腈 (ioxynil) 、 咪 草 酸 (imazamethabenz-methyl) 、 咪 唑 菸 酸 (imazapyr) 、 咪 唑 喹 啉 酸 (imazaquin) 、 咪 草 煙 (imazethapyr) 、 甲 咪 唑 煙 酸 (imazapic) 、 甲 氧 咪 草 煙 (imazamox) 、 丙 炔 氟 草 胺 (flumioxazin) 、 氟 烯 草 酸 (flumiclorac-pentyl) 、 毒 莠 定 (picloram) 、 噻 密 磺 隆 (amodosulfuron) 、 氯 磺 隆 (chlorsulfuron) 、 煙 密 磺 隆 (nicosulfuron) 、 玉 密 磺 隆 (rimsulfuron) 、 醚 苯 磺 隆 (triasulfuron) 、 野 麥 畏 (triallate) 、 克 草 猛 (pebulate) 、 苄 草 丹 (prosulfocarb) 、 禾 草 敵 (molinat) 、 阿 特 拉 津 (atrazine) 、 西 瑪 津 (simazine) 、 草 淨 津 (cyanazine) 、 莠 滅 淨 (ametryn) 、 撲 草 淨 (prometryn) 、 特 丁 津 (terbuthylazine) 、 去 草 淨 (terbutryn) 、 磺 草 酮 (sulcotrione) 、 異 丙 隆 (isoproturon) 、 利 穀 隆 (linuron) 、 非 草 隆 (fenuron) 、 氯 麥 隆 (chlorotoluron) 與 甲 氧 隆 (metoxuron) 。

合 適 的 殺 真 菌 劑 包 括 異 吡 銳 殺 (isopyrazam) 、 雙 快 噠

菌 胺 (mandipropamid)、嘧 菌 酯 (azoxystrobin)、肟 菌 酯 (trifloxystrobin)、醚 菌 酯 (kresoximmethyl)、噁 唑 菌 酮 (famoxadone)、苯 氧 菌 胺 (metominostrobin)與 啉 氧 菌 酯 (picoxystrobin)、嘧 菌 環 胺 (cyprodanil)、多 菌 靈 (carbendazim)、噻 菌 靈 (thiabendazole)、烯 鹽 嗎 啉 (dimethomorph)、乙 烯 菌 核 利 (vinclozolin)、異 菌 脲 (iprodione)、二 硫 代 胺 基 甲 酸 酯 (dithiocarbamate)、抑 微 唑 (imazalil)、咪 鮮 胺 (prochloraz)、氟 喹 唑 (fluquinconazole)、氟 環 唑 (epoxiconazole)、粉 唑 醇 (flutriafol)、氮 康 唑 (azaconazole)、雙 苯 三 唑 醇 (bitertanol)、糠 菌 唑 (bromuconazole)、環 唑 醇 (cyproconazole)、惡 醚 唑 (difenoconazole)、己 唑 醇 (hexaconazole)、多 效 唑 (paclobutrazole)、丙 環 唑 (propiconazole)、戊 唑 醇 (tebuconazole)、三 唑 酮 (triadimefon)、滅 菌 唑 (triticiconazole)、丁 苯 嗎 啉 (fenpropimorph)、十 三 嗎 啉 (tridemorph)、苯 鏽 啉 (fenpropidin)、代 森 錳 鋅 (mancozeb)、代 森 聯 (metiram)、百 菌 清 (chlorothalonil)、福 美 雙 (thiram)、二 甲 氨 荒 酸 鋅 (ziram)、敵 菌 丹 (captan)、克 菌 丹 (captan)、滅 菌 丹 (folpet)、氟 啉 胺 (fluazinam)、福 多 寧 (flutolanil)、萎 銹 靈 (carboxin)、甲 霜 靈 (metalaxyl)、乙 嘧 酚 磺 酸 酯 (bupirimate)、乙 嘧 酚 (ethirimol)、醚 菌 胺 (dimoxystrobin)、氟 嘧 菌 酯 (fluoxastrobin)、肟 醚 菌 胺 (orysastrobin)、苯 氧 菌 胺 (metominostrobin)與 丙 硫 菌 唑 (prothioconazole)。

合適的殺蟲劑包括噻蟲嗪 (thiamethoxam)、吡蟲啉 (imidacloprid)、啉蟲脒 (acetamiprid)、噻蟲胺 (clothianidin)、呋蟲胺 (dinotefuran)、烯啶蟲胺 (nitenpyram)、氟蟲腈 (fipronil)、阿維菌素 (abamectin)、甲胺基阿維菌素 (emamectin)、惡蟲威 (bendiocarb)、西維因 (carbaryl)、苯氧威 (fenoxycarb)、異丙威 (isoprocarb)、抗蚜威 (pirimicarb)、殘殺威 (propoxur)、滅殺威 (xylylcarb)、黃草靈 (asulam)、氯普芬 (chlorpropham)、硫丹 (endosulfan)、七氯 (heptachlor)、蟲醯肼 (tebufenozide)、殺蟲磺 (bensultap)、乙微威 (diethofencarb)、甲基嘧啶磷 (pirimiphos methyl)、涕滅威 (aldicarb)、滅多威 (methomyl)、氯氰菊酯 (cypermethrin)、生物烯丙菊酯 (bioallethrin)、溴氰菊酯 (deltamethrin)、三氟氯氰菊酯 (lambda cyhalothrin)、氯氟氯氰菊酯 (cyhalothrin)、氟氯氰菊酯 (cyfluthrin)、氰戊菊酯 (fenvalerate)、炔咪菊酯 (imiprothrin)、氯菊酯 (permethrin) 與合芬寧 (halfenprox)。

合適的植物生長調節劑包含多效唑 (paclobutrazole) 與 1-甲基環丙烯 (1-methylcyclopropene)。

合適的安全劑包括解草嗪 (benoxacor)、解毒唑 (cloquintocet-mexyl)、解草胺腈 (cyometrinil)、二氯丙烯胺 (dichlormid)、解草唑 (fenchlorazole-ethyl)、解草啉 (fencloirim)、解草胺 (flurazole)、氟草肼 (fluxofenim)、吡唑解草酯 (mefenpyr-diethyl)、MG-191、萘二甲酸酐

(naphthalic anhydride)與解草腓(oxabetrinil)。

當然，各種不同版本的《The Pesticide Manual》（除害劑手冊）[特別是第 14 與第 15 版]也揭露農用化學品的詳細內容，其任何一者都適合和本發明配合使用。

嫻熟相關技術的人將會明瞭，本發明的組成物可包含上述一或多種農用化學品。

本發明的組成物一般包含此技術領域所建議量的農用化學品。通常，式（I）化合物佔總組成物的約 0.0005%至約 90% v/v。

嫻熟相關技術的人將會明瞭，本發明的組成物可呈即用調合物的形式，或呈適合讓末端使用者進一步稀釋的濃縮形式，而農用化學品與式（I）化合物的濃度則依此進行調整。在濃縮形式下，本發明的組成物通常含有 5 至 75% v/v 的農用化學品，較佳為 10 至 50% v/v 的農用化學品。本發明的即用組成物通常包含 0.0001%至 1% v/v，較佳是 0.001%至 0.5% v/v，更佳是 0.001%至 0.1% v/v 農用化學品。

通常，式（I）化合物佔總組成物大約 0.0005%至大約 90% v/v。當佐劑密度大約為 1 時，嫻熟相關技術的人將會明瞭，v/v 的測量值會近似於 w/v 的測量值，而且在式（I）化合物為液體的情況下，v/v 通常為較恰當的測量方式。在濃縮形式下，本發明的組成物通常含有 1%至 80%（v/v 或 w/v）的式（I）化合物，較佳的是 5%至 60%（v/v 或 w/v），更佳的是 10%（w/v 或 v/v）至 40%（w/v

或 v/v) 。本發明的即用組成物通常含有總組成物大約 0.05% 至大約 1% w/v (或 v/v) 的式 (I) 化合物，更佳的是總組成物大約 0.1% 至大約 0.5% w/v (或 v/v) 的式 (I) 化合物。在特定的實施態樣中，該芳族酯會以總組成物之 0.1%、0.2%、0.25%、0.3%、0.4% 或 0.5% w/v (或 v/v) 的濃度包括在內。

式 (I) 化合物可個別製造及 / 或調製，且爲了用作佐劑，可在後續階段 (通常是緊接在使用前) 將其添加至個別的農用化學調合物中。

本發明的組成物可以熟習相關技術之人士已知的任何適當方式調製而成。如上所述，本發明之組成物的一種形式即是調合物濃縮物，末端使用者 (通常爲農夫) 可先在噴霧槽中將其稀釋或分散 (通常於水中) ，再進行施用。

在此類調合物中，除了式 (I) 化合物或本發明的組成物外還可混合其他調合物成分。此類額外的成分包含諸如佐劑、界面活性劑、乳化劑與溶劑，並爲熟習相關技術人士所熟知：標準調合物刊物揭露此類適合與本發明搭配使用的調合物成分 (例如，*《Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations》* (農用化學調合物的化學與技術，編輯：Alan Knowles，出版社：Kluwer Academic Publishers，荷蘭，1998 年) ；與 *《Adjuvants and Additives : 2006 Edition》* (佐劑與添加劑：2006 版) ，Alan Knowles 著，Agrow Report DS256，出版社：Informa UK Ltd，2006 年 12 月。其他適合與本發明搭配使用的標

準調合物成分揭露於 WO2009/130281A1 (請參閱第 46 頁第 5 行至第 51 頁第 40 行)。

因此，本發明的組成物也可包含一或多種界面活性劑或分散劑，以在水性介質（分散劑系統）中分散或稀釋時輔助農用化學品的乳化。乳化系統的存在主要是為了協助維持水中乳化的農用化學品。許多適合用於形成農用化學品之乳化系統的個別乳化劑、界面活性劑與其混合物是熟習相關技術之人士所熟知，並具有相當廣泛的選擇。可用於形成乳化劑系統的典型界面活性劑包括含有以下項目的界面活性劑：環氧乙烷、環氧丙烷，或同時含有環氧乙烷與環氧丙烷；芳基或烷基芳基磺酸酯，及其與環氧乙烷或環氧丙烷或兩者的組合；羧酸酯及其與環氧乙烷或環氧丙烷或兩者的組合。聚合物與共聚物亦為普遍使用者。

本發明的組成物也可包含溶劑（其可具有一範圍的水溶性）。水溶性極低的油脂類可基於各種原因而被添加至本發明的溶劑中，例如提供香味、安全化、降低成本、改善乳化性質與改變溶解力。也可基於各種原因而添加具有較高水溶性的溶劑，例如為改變調合物在水中乳化的容易度、改善除害劑（pesticide）的溶解度或調合物中其他選擇性使用之添加劑的溶解度、改變調合物的黏度或增加商業利益等等。

其他可添加至調合物中的選擇性成分包括例如著色劑、香味劑與其他對典型農用化學調合物有益的材料。

本發明的化合物及/或組成物可調製成例如乳液或分

散液濃縮體、水中或油中的乳液、微膠囊調合物、氣溶膠噴霧或霧化調合物；且這些可進一步調製到粒狀材料或粉末中，例如用於乾式施用或作為水可分散的調合物。較佳的是，將本發明的組成物調製成微膠囊或其中成分。

本發明的組成物可用於防治有害生物（pest）。文中所用的「有害生物」一詞包含昆蟲、真菌、軟體動物、線蟲與不想要的植物。因此，為了防治有害生物，可直接將本發明的組成物施用於該有害生物上或有害生物的所在之處。

本發明的組成物在種子處理領域中也具有實用性，因此可在適合時施於種子。

嫻熟相關技術的人將會明瞭，上述有關本發明各種方面與實施態樣的較佳情況可以任何被視為適當的方式加以組合。

本發明之各種方面與實施態樣，現在將藉由實施例來作更詳細的說明。將會明瞭的是，可在不脫離本發明範圍的情況下，對詳細內容作修改。

實施例 1： 4-十二烷基-N-[2-(2-{2-[2-(2-{2-[2-(2-羥基-乙氧基)-乙氧基]-乙氧基}-乙氧基)-乙氧基]-乙氧基}-乙氧基)-乙基]-苯甲醯胺（編號 2 化合物）的合成

以 N,N'-二環己基碳二亞胺（DCC）當作耦合劑，讓對-十二烷基苯甲酸與八伸乙氧胺（octaethylene oxide

amine) 反應，以合成 4-十二烷基-N-[2-(2-{2-[2-(2-{2-[2-(2-羥基-乙氧基)-乙氧基]-乙氧基}-乙氧基)-乙氧基]-乙氧基}-乙氧基)-乙基]-苯甲醯胺(以上表 1 的編號 2 化合物)。

實施例 2：4-十二烷基-N-[2-(2-{2-[2-(2-{2-[2-(2-羥基-乙氧基)-乙氧基]-乙氧基}-乙氧基)-乙氧基]-乙氧基}-乙氧基)-乙基]-苯甲醯胺(編號 2 化合物)在煙嘧磺隆(nicosulfuron)調合物中作為佐劑

在溫室中針對四種雜草種類對編號 2 化合物(請見以上實施例 1 與表 1)結合除草劑煙嘧磺隆進行測試。在履帶式噴霧機中製備含有 0.2% v/v 佐劑之農用化學組成物，並以每公頃 200 公升的體積施用此組成物。對已成長至 1.3 或 1.4 葉期的雜草施用煙嘧磺隆，每公頃除害劑之量為 30 或 60 克。雜草種類為藜屬(*Chenopodium album*, CHEAL)、蒺藜(*Abutilon theophrasti*, ABUTH)、寬葉臂形草(*Brachiaria platyphylla*, BRAPP)與馬唐(*Digitaria sanguinalis*, DIGSA)。

每項噴灑測試皆反覆進行三次。以目測方式評估除草劑的能效，並以殺除之葉面積的百分比來表示能效。在施用後 7、14 和 21 天時，對樣本進行評估。以下表 2 所顯示的結果，是在經過兩種煙嘧磺隆施用比率、三次反覆測試，與三次時間點的評估後所獲得的平均值。將這些結果

與煙嘧磺隆結合市售槽混佐劑 Turbocharge® D (Syngenta Crop Protection Canada, Inc.) 所得之結果相比較，可在每種情況下發現，當調合物中含有化合物 2 作為佐劑時，會觀察到極佳的雜草防治情形。

表 2 煙嘧磺隆在編號 2 化合物存在下與煙嘧磺隆在 Turbocharge® D 存在下有關殺滅結果(平均百分比)的比較。

佐劑	CHEAL	ABUTH	BRAPP	DIGSA	平均值(g/ha)
編號 2 化合物	80	47.1	86.4	83.1	73.9
Turbocharge	76.7	41.7	80.6	64.8	65.9

實施例 3：使用編號 2 化合物作為氟磺胺草醚 (fomesafen) 的佐劑

在溫室中針對四種雜草種類對編號 2 化合物結合除草劑氟磺胺草醚進行測試。在履帶式噴霧機中製備含有 0.2% v/v 佐劑之農用化學組成物，並以每公頃 200 公升的體積施用此組成物。對已成長至 1.3 或 1.4 葉期的雜草施用氟磺胺草醚，每公頃之除害劑的量為 60 或 120 克。雜草種類為藜屬 (CHEAL)、蒺藜 (ABUTH)、狗尾草 (*Setaria viridis*, SETVI) 與蒼耳 (*Xanthium strumarium*, XANST)。

每項噴灑測試皆反覆進行六次。以目測方式評估除草劑的功效，並以殺除之葉面積的百分比來表示功效。在施用後 7 和 14 天時，對樣本進行評估。以下表 3 所顯示的結果，是在經過兩種氟磺胺草醚施用比率、六次反覆測試，與兩次時間點的評估後所獲得的平均值，將這些結果與

無佐劑之下的氟磺胺草醚的功効相比較。

表 3 氟磺胺草醚在有、無化合物 2 的情況下，有關殺滅結果的平均百分比

佐劑	ABUTH	CHEAL	SETVI	XANST	跨物種的平均值
化合物 2	90	34.1	41.7	68.8	58.6
無	60.8	43.3	38.2	45.8	47.0

實施例 4：使用化合物 2 作為硝磺草酮（mesotrione）的佐劑

在溫室中針對四種雜草種類對編號 2 化合物結合除草劑硝磺草酮進行測試。在履帶式噴霧機中製備含有 0.2% v/v 佐劑之農用化學組成物，並以每公頃 200 公升的體積施用此組成物。對已成長至 1.3 或 1.4 葉期的雜草施用硝磺草酮，每公頃之除害劑的量為 60 或 120 克。雜草種類為反枝苋（*Amaranthus retroflexus*, AMARE）、綠麻（ABUTH）、寬葉臂形草（*Brachiaria platyphylla*, BRAPP）與馬唐（DIGSA）。

每項噴灑測試皆反覆進行六次。以目測方式評估除草劑的功効，並以殺除之葉面積的百分比來表示功効。在施用後 6、14 和 21 天時，對樣本進行評估。以下表 4 所顯示的結果，是在經過兩種硝磺草酮施用比率、六次反覆測試，與三次時間點的評估後所獲得的平均值。將這些結果與硝磺草酮結合市售槽混佐劑 Turbocharge® D（Syngenta Crop Protection Canada, Inc.）所得之結果相比較。

表 4 硝磺草酮在化合物 2 存在下與硝磺草酮在 Turbocharge® D 存在下
有關殺滅結果(平均百分比)的比較。

佐劑	AMARE	ABUTH	BRAPP	DIGSA	跨物種的平均值
化合物 2	63.5	73.3	68.2	83.4	72.1
Turbocharge	67.2	73.8	58.2	79.7	69.8

實施例 5：使用化合物 1 (*N,N*-二乙基-3-甲基苯甲醯胺)
作為氟磺胺草醚的佐劑

使用除草劑氟磺胺草醚，在溫室中針對四種雜草種類對化合物 1 (*N,N*-二乙基-3-甲基苯甲醯胺) 進行測試。在履帶式噴霧機中製備含有 0.2% v/v 佐劑之農用化學組成物，並以每公頃 200 公升的體積施用此組成物。對每種雜草種類施用氟磺胺草醚，每公頃之除害劑的量為 60 或 120 克。雜草種類及其在噴灑時的生長階段為 藜屬 (CHEAL；生長階段 13/14)、 綠麻 (ABUTH；生長階段 12)、 狗尾草 (SETVI；生長階段 13) 與 蒼耳 (XANST；生長階段 12)。

每項噴灑測試皆反覆進行三次。以目測方式評估除草劑的功效，並以殺除之葉面積的百分比來表示功效。在施用後 7、14 和 21 天時，對樣本進行評估。以下表 5 所顯示的結果，是在經過兩種氟磺胺草醚施用比率、三次反覆測試，與三次時間點的評估後所獲得的平均值，將這些結果與無佐劑之下的氟磺胺草醚的功效相比較。

表 5 氟磺胺草醚在有、無化合物 1 的情況下，有關殺滅結果的平均百分比。

佐劑	CHEAL	ABUTH	SETVI	XANST	跨物種的平均值
化合物 1	80.3	38.9	15.8	35.6	42.6
無	77.5	20	10.6	42.8	37.7

實施例 6：使用化合物 1 作為硝磺草酮的佐劑

使用除草劑硝磺草酮，在溫室中針對四種雜草種類對化合物 1 進行測試。製備化合物 1 的 20%w/w 儲藏乳液，其額外含有 2%w/w Gohsenol® GL03 與 2%w/w Pluronic® PE10500 作為界面活性劑。以此在履帶式噴霧機中製備含有 0.2% v/v 佐劑之農用化學組成物，並以每公頃 200 公升的體積施用此組成物。對每種雜草種類施用硝磺草酮，每公頃除害劑的量為 45 或 90 克。雜草種類及其在噴灑時的生長階段為糙果莧 (*Amaranthus tuberculatus*, AMATE; 生長階段 13/14)、臂形草 (*Brachiaria decumbens*, BRADE; 生長階段 13/14)、馬唐 (*DIGSA*; 生長階段 14) 和卷莖蓼 (*Polygonum convolvulus*, POLCO; 生長階段 11/11.5)。

每項測試皆反覆進行三次。以目測方式評估除草劑的功效，並以殺除之葉面積的百分比來表示功效。在施用後 7、14 和 21 天時，對樣本進行評估。以下表 6 所顯示的結果，是在經過兩種硝磺草酮施用比率、三次反覆測試，與三次時間點的評估後所獲得的平均值，將這些結果與無佐劑之硝磺草酮的功效相比較。

表 6 硝磺草酮在有、無化合物 1 的情況下，有關殺滅結果的平均百分比

佐劑	AMATE	BRADE	DIGSA	POLCO	跨物種的平均值
化合物 1	71.7	28.9	28.6	87.2	54.1
無	65.6	26.7	23	73.3	47.1

實施例 7：使用化合物 1 作為煙嘧磺隆的佐劑

使用除草劑煙嘧磺隆，在溫室中針對四種雜草種類對化合物 1 進行測試。製備化合物 1 的 20%w/w 儲藏乳液，其額外含有 2%w/w Gohsenol® GL03 與 2%w/w Pluronic® PE10500 作為界面活性劑。以此在履帶式噴霧機中製備含有 0.2% v/v 佐劑之農用化學組成物，並以每公頃 200 公升的體積施用此組成物。對每種雜草種類施用煙嘧磺隆，每公頃之除害劑的量為 30 或 60 克。雜草種類及其在噴灑時的生長階段為 蒺藜 (ABUTH；生長階段 13)、藜屬 (CHEAL；生長階段 14)、馬唐 (DIGSA；生長階段 13) 與狗尾草 (SETVI；生長階段 13)。

每項噴灑測試皆反覆進行三次。以目測方式評估除草劑的功效，並以殺除之葉面積的百分比來表示功效。在施用後 14 和 21 天時，對樣本進行評估。以下表 7 所顯示的結果，是在經過兩種煙嘧磺隆施用比率、三次反覆測試，與兩次時間點的評估後所獲得的平均值，將這些結果與無佐劑之下的煙嘧磺隆的功效相比較。

表 7 煙嘧磺隆在有、無化合物 1 的情況下，有關殺滅結果的平均百分比。

佐劑	ABUTH	CHEAL	DIGSA	SETVI	跨物種的平均值
化合物 1	72.9	63.8	89.4	93.4	81.3
無	69.2	50.8	87.9	92	75

實施例 8：使用化合物 1 作為唑啞草酯（pinoxaden）的佐劑

在溫室中針對四種雜草種類對實施例 1 中所示之佐劑結合除草劑唑啞草酯進行測試。製備化合物 1 的 20%w/w 儲藏乳液，其額外含有 2%w/w Gohsenol® GL03 與 2%w/w Pluronic® PE10500 作為界面活性劑。以此在履帶式噴霧機中製備含有 0.2% v/v 佐劑之農用化學組成物，並以每公頃 200 公升的體積施用此組成物。對每種雜草種類施用唑啞草酯，每公頃之除害劑的量為 7.5 或 15 克。雜草種類及其在噴灑時的生長階段為大穗看麥娘（*Alopecurus myosuroides*, ALOMY；生長階段 13）、野燕麥（*Avena fatua*, AVEFA；生長階段 12）、黑麥草（*Lolium perenne*, LOLPE；生長階段 13）與狗尾草（SETVI；生長階段 14）。

每項噴灑測試皆反覆進行三次。以目測方式評估除草劑的功效，並以殺除之葉面積的百分比來表示功效。在施用後 14 和 21 天時，對樣本進行評估。表 8 所顯示的結果，是在經過兩種唑啞草酯施用比率、三次反覆測試，與兩次時間點的評估後所獲得的平均值，將這些結果與無佐劑

之下的唑啞草酯的功効相比較。

表 8 唑啞草酯在有、無化合物 1 的情況下，有關殺滅結果的平均百分比

佐劑	ALOMY	AVEFA	LOLPE	SETVI	跨物種的平均值
新穎佐劑 1	22.5	29.2	20.8	15.8	22.1
唑啞草酯	21.2	20.8	12.5	15	17.4

實施例 9：製造乙氧基化芳族醯胺(化合物 3、4、5 和 6)

以上表 1 的化合物 3、4、5 和 6 的製備方式如下。自蘇格蘭聖安德魯斯之聖安德魯斯大學 (St Andrews University) 的 St Andrews Chemicals 購買聚乙二醇的單元胺四種樣本 (A、B、C 和 D)。依說明，這些樣本分別具有 5、10、15 和 20 個伸乙氧部分，但在 nmr 光譜分析後發現，其具有如表 9 所示平均數量的伸乙氧部分。

表 9 以 nmr 光譜法評估之聚乙二醇單元胺樣本的乙氧基化程度

樣本	測得的 EO 單元平均數
A：單乙醇胺 4EO	5
B：單乙醇胺 9EO	10.2
C：單乙醇胺 14EO	14.5
D：單乙醇胺 19EO	19.2

利用以下所述的一般方法學，使用這些胺類 (A、B、C 和 D) 之各者來製造芳族醯胺。

將單乙醇胺聚環氧乙烷添加至含有苯甲醯氯與溶劑四氫呋喃的反應燒瓶中。將燒瓶密封後，放置在微波反應器中。把樣本加熱至 140°C 與 7 巴壓力歷時五分鐘。表 10 摘錄個別反應的反應物量與產物產率。

表 10

PEG 單乙醇胺樣本 (g)	苯甲醯氯 (g)	THF (ml)	醯胺產物 (參照以上表 1)	醯胺產率%
A(1.01)	0.687	5	化合物 3	85
B(1)	0.424	5	化合物 4	78
C(1)	0.239	5	化合物 5	93
D(0.96)	0.216	5	化合物 6	76

所產生的醯胺產物透過在丙酮中溶解然後用己烷使其沈澱的方式純化。產物結構經過 nmr 光譜法檢查，證實為如以上表 1 中所示者。

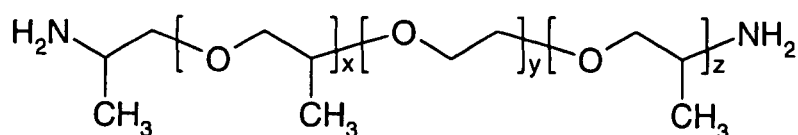
實施例 10：製造乙氧基化芳族醯胺

利用以上實施例 8 敘述的方法學，使苯甲醯氯與具有平均 8EO 之聚環氧乙烷的二元胺反應，形成具有如以上表 1 中所示化合物 7 結構的芳族醯胺。

實施例 11：製造乙氧基/丙氧基化芳族醯胺

使苯甲醯氯與 Jeffamine® ED600（美國德州的 Huntsman Performance Products 公司）反應。

Jeffamine® ED 系列的聚醚胺是基於主要為 PEG 主幹的聚醚二胺。它們具有以下代表性結構：

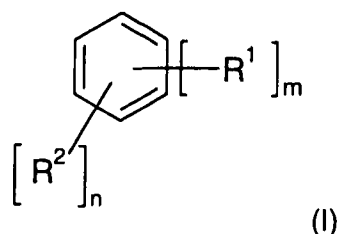


對於 Jeffamine® ED600，特性如下： $y \sim 9.0$ ， $(x+z) \sim 3.6$ ，分子量 ~ 600 。

該反應形成帶有末端胺基之聚乙烯/聚丙烯共聚物的混合苯甲酸鹽胺酯 (benzoate amide ester)。乙氧化與丙氧化的程度混合，而且該酯具有平均 9EO 部分與平均 3.6 PO 部分。

七、申請專利範圍：

1. 一種如式 (I) 之化合物作為佐劑之用途



其中 m 是 1、2 或 3 的整數；

n 是 0、1、2 或 3 的整數；

R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$ ；

各個 R^2 係獨立為 C_{1-15} 烷基，

各個 R^3 係獨立為 H 或 C_{1-6} 烷基，

各個 R^4 係獨立為 C_{1-8} 烷基或基團 $-\text{[AO]}_x-\text{R}^5$ ，其中 x 是 0 至 20 的整數，各個 A 係獨立為 C_{1-4} 烷基，且各個 R^5 係獨立為 H、 C_{1-4} 烷基或 NH_2 。

2. 一種如申請專利範圍第 1 項中所定義的式 (I) 化合物，但當 m 為 1 且 n 為 1 時：

(i) 當 R^2 為間位的甲基時，則當 R^4 為乙基時 R^3 不為乙基，而當 R^4 為甲基時 R^3 不為甲基；

(ii) 當 R^2 為鄰位的甲基時，則：當 R^4 為丙基或三級丁基時 R^3 不為甲基，當 R^4 為乙基、正丙基或正丁基時 R^3 不為正丙基，當 R^4 為甲基、乙基或正丁基時 R^3 不為正丁基，當 R^4 為異丁基時 R^3 不為異丁基，當 R^3 為 H、丙基、三級丁基或正戊基時 R^4 不為甲基，當 R^3 為乙基時 R^4

不為正丙基，當 R^3 為乙基時 R^4 不為正丁基，當 R^3 為 H 或甲基時 R^4 不為戊基，當 R^3 為 H 或甲基時 R^4 不為 2-乙基-己基；以及

(iii) 當 R^2 為對位的甲基或鄰位的乙基時， R^3 與 R^4 不能兩者皆為甲基。

3. 如申請專利範圍第 1 或 2 項所定義的式 (I) 化合物，其中至少一個 R^4 為基團 $-[AO]_x-R^5$ ，其中 A、x 和 R^5 係如申請專利範圍第 1 項中所定義者。

4. 如申請專利範圍第 1 至 3 項中任一項所定義的式 (I) 化合物，其中至少一個 R^2 處於對位。

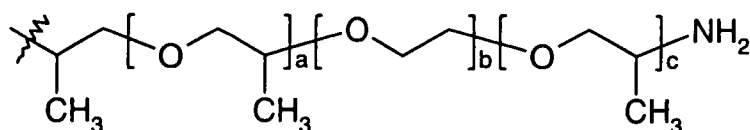
5. 如申請專利範圍第 2 至 4 項中任一項的化合物，其中：

各個 R^2 係獨立為甲基或 C_{6-12} 烷基；

且其中在至少一個 R^1 中， R^3 選自由 H、甲基、乙基、丙基及丁基所組成的群組；

且 R^4 選自由 C_{2-8} 烷基及基團 $-[AO]_xR^5$ (其中 A 為乙基或丙基，且 x 為 7-18 的整數) 所組成的群組。

6. 如申請專利範圍第 2 至 5 中任一項的化合物，其中在至少一個 R^1 中， R^3 為 H，且 R^4 為基團



，其中「b」的值為 9，而「a」和「c」的總和為 3 或 4。

7. 如申請專利範圍第 2 至 6 項中任一項的化合物，

其中 n 爲 1 且 m 爲 1 或 2。

8. 如申請專利範圍第 2 至 7 項中任一項的化合物，其中 n 爲 1 且 m 爲 1。

9. 如申請專利範圍第 2 至 7 項中任一項的化合物，其中 n 爲 0 且 m 爲 1。

10. 一種如申請專利範圍第 2 至 9 項中任一項所定義的化合物作爲佐劑之用途。

11. 一種農用化學組成物，包含如申請專利範圍第 2 至 9 項中任一項所定義的化合物及農用化學品。

12. 如申請專利範圍第 11 項之農用化學組成物，其中式 (I) 化合物佔總組成物約 0.0005% 至約 90% w/v。

13. 如申請專利範圍第 11 或 12 項的農用化學組成物，其中該農用化學品是選自由下列物質所組成的群組：雙環哌啶 (bicyclopyrone)、硝磺草酮 (mesotrione)、氟磺胺草醚 (fomesafen)、三甲苯草酮 (tralkoxydim)、敵草胺 (napropamide)、雙甲脒 (amitraz)、敵稗 (propanil)、嘧啶胺 (pyrimethanil)、氯硝胺 (dicloran)、四氯硝基苯 (tecnazene)、甲基立枯磷 (toclofos methyl)、麥草氟酯 (flampropM)、2,4-D、MCPA、2-甲基-4-氯苯氧基丙酸 (mecoprop)、快草酯 (clodinafop-propargyl)、氰氟草酯 (cyhalofop-butyl)、禾草靈 (diclofop methyl)、吡氟氯禾靈 (haloxyfop)、精喹禾靈-P (quizalofop-P)、吲哚-3-基乙酸 (indol-3-ylacetic acid)、1-萘乙酸 (1-naphthylacetic acid)、異惡醯草胺 (isoxaben)、牧草胺 (tebutam)、二甲基敵草索

(chlorthal dimethyl)、苯菌靈(benomyl)、呋草黃(benfuresate)、麥草畏(dicamba)、敵草腈(dichlobenil)、草除靈(benazolin)、咪唑嗪(triazoxide)、氟佐隆(flauazuron)、伏蟲隆(teflubenzuron)、苯敵草(phenmedipham)、乙草胺(acetochlor)、甲草胺(alachlor)、異丙甲草胺(metolachlor)、丙草胺(pretilachlor)、甲氧噻草胺(thenylchlor)、亞汰草(alloxydim)、丁氧環酮(butroxydim)、烯草酮(clethodim)、賽克羅定(cyclodim)、稀禾定(sethoxydim)、吡喃草酮(tepraloxym)、二甲戊樂靈(pendimethalin)、特樂酚(dinoterb)、甲羧除草醚(bifenox)、氟硝草醚(oxyfluorfen)、三氟羧草醚(acifluorfen)、乙羧氟草醚(fluoroglycofen-ethyl)、溴苯腈(bromoxynil)、碘苯腈(ioxynil)、咪草酸(imazamethabenz-methyl)、咪唑菸酸(imazapyr)、咪唑喹啉酸(imazaquin)、咪草煙(imazethapyr)、甲咪唑煙酸(imazapic)、甲氧咪草煙(imazamox)、丙炔氟草胺(flumioxazin)、氟烯草酸(flumiclorac-pentyl)、毒莠定(picloram)、噻嘧磺隆(amodosulfuron)、氯磺隆(chlorsulfuron)、煙嘧磺隆(nicosulfuron)、玉嘧磺隆(rimsulfuron)、醚苯磺隆(triasulfuron)、野麥畏(triallate)、克草猛(pebulate)、苄草丹(prosulfocarb)、禾草敵(molinate)、阿特拉津(atrazine)、西瑪津(simazine)、草淨津(cyanazine)、莠滅淨(amestryl)、撲草淨(prometryl)、特丁津(terbuthylazine)、去草淨(terbutryl)、磺草酮(sulcotrione)、異丙隆

(isoproturon)、利穀隆(linuron)、非草隆(fenuron)、氯麥隆(chlorotoluron)、甲氧隆(metoxuron)、異吡銳殺(isopyrazam)、雙炔醯菌胺(mandipropamid)、嘧菌酯(azoxystrobin)、肟菌酯(trifloxystrobin)、醚菌酯(kresoxim methyl)、噁唑菌酮(famoxadone)、苯氧菌胺(metominostrobin)與啉氧菌酯(picoxystrobin)、嘧菌環胺(cyprodanil)、多菌靈(carbendazim)、噻菌靈(thiabendazole)、烯醯嗎啉(dimethomorph)、乙烯菌核利(vinclozolin)、異菌脲(iprodione)、二硫代胺基甲酸酯(dithiocarbamate)、抑黴唑(imazalil)、咪鮮胺(prochloraz)、氟啶唑(fluquinconazole)、氟環唑(epoxiconazole)、粉唑醇(flutriafol)、氮康唑(azaconazole)、雙苯三唑醇(bitertanol)、糠菌唑(bromuconazole)、環唑醇(cyproconazole)、惡醚唑(difenoconazole)、己唑醇(hexaconazole)、多效唑(paclobutrazole)、丙環唑(propiconazole)、戊唑醇(tebuconazole)、三唑酮(triadimefon)、滅菌唑(triticonazole)、丁苯嗎啉(fenpropimorph)、十三嗎啉(tridemorph)、苯鏽啉(fenpropidin)、代森錳鋅(mancozeb)、代森聯(metiram)、百菌清(chlorothalonil)、福美雙(thiram)、二甲氨基荒酸鋅(ziram)、敵菌丹(captafol)、克菌丹(captan)、滅菌丹(folpet)、氟啶胺(fluzinam)、福多寧(flutolanil)、萎銹靈(carboxin)、甲霜靈(metalaxyl)、乙嘧酚磺酸酯(bupirimate)、乙嘧酚(ethirimol)、醚菌胺(dimoxystrobin)

、 氟 嘧 菌 酯 (fluoxastrobin)、 肟 醚 菌 胺 (orysastrobin)、 苯
 氧 菌 胺 (metominostrobin)、 丙 硫 菌 唑 (prothioconazole)、
 噻 蟲 嗪 (thiamethoxam)、 吡 蟲 啉 (imidacloprid)、 啉 蟲 脒
 (acetamiprid)、 噻 蟲 胺 (clothianidin)、 呋 蟲 胺
 (dinotefuran)、 烯 啉 蟲 胺 (nitenpyram)、 氟 蟲 腈 (fipronil)、
 阿 維 菌 素 (abamectin)、 甲 胺 基 阿 維 菌 素 (emamectin)、 惡 蟲
 威 (bendiocarb)、 西 維 因 (carbaryl)、 苯 氧 威 (fenoxycarb)、
 異 丙 威 (isoprocarb)、 抗 蚜 威 (pirimicarb)、 殘 殺 威
 (propoxur)、 滅 殺 威 (xylylcarb)、 黃 草 靈 (asulam)、 氯 普 芬
 (chlorpropham)、 硫 丹 (endosulfan)、 七 氯 (heptachlor)、 蟲
 醯 肼 (tebufenozide)、 殺 蟲 磺 (bensultap)、 乙 黴 威
 (diethofencarb)、 甲 基 嘧 啉 磷 (pirimiphosmethyl)、 涕 滅 威
 (aldicarb)、 滅 多 威 (methomyl)、 氯 氰 菊 酯 (cyprmethrin)、
 生 物 烯 丙 菊 酯 (bioallethrin)、 溴 氰 菊 酯 (deltamethrin)、 三
 氯 氯 氰 菊 酯 (lambda cyhalothrin)、 氯 氯 氯 菊 酯
 (cyhalothrin)、 氯 氯 氯 菊 酯 (cyfluthrin)、 氯 戊 菊 酯
 (fenvalerate)、 炔 咪 菊 酯 (imiprothrin)、 氯 菊 酯
 (permethrin)、 合 芬 寧 (halfenprox)、 多 效 唑
 (paclobutrazole)、 1-甲 基 環 丙 烯 (1-methylcyclopropene)、
 解 草 嗪 (benoxacor)、 解 毒 啞 (cloquintocet-mexyl)、 解 草 胺
 腈 (cyometrinil)、 二 氯 丙 烯 胺 (dichlormid)、 解 草 唑
 (fenchlorazole-ethyl)、 解 草 啉 (fenclozim)、 解 草 胺
 (flurazole)、 氟 草 肟 (fluxofenim)、 吡 啉 解 草 酯 (mefenpyr-
 diethyl)、 MG-191、 萘 二 甲 酸 酐 (naphthalic anhydride)、

與解草腈 (oxabetrinil)。

14. 如申請專利範圍第 11 至 13 項中任一項的農用化學組成物，其中該組成物被調製成微膠囊或其中成分。

15. 如申請專利範圍第 11 至 14 項中任一項的農用化學組成物，其中該組成物為乳液濃縮體 (EC) 或分散液濃縮體 (DC)。

16. 如申請專利範圍第 11 至 15 項中任一項的農用化學組成物，其包含至少一種選自由以下物質所組成之群組的額外成分：農用化學品、佐劑、界面活性劑、乳化劑和溶劑。

17. 一種如申請專利範圍第 11 至 16 項中任一項所定義的農用化學組成物的用途，是用來防治有害生物 (pest)。

18. 一種防治有害生物的方法，包括將如申請專利範圍第 11 至 16 項中任一項所定義的組成物施於該有害生物或該有害生物的所在之處。

19. 一種製造農用化學組成物的方法，其包含提供：

i. 農用化學品；及

ii. 如申請專利範圍第 2 至 9 項中任一項所定義的式 (I) 化合物；

及將該農用化學品與式 (I) 化合物組合。

20. 如申請專利範圍第 19 項的方法，其中該農用化學組成物係如申請專利範圍第 11 至 16 項中任一項所定義者。

21. 一種提高農用化學品之功效的方法，包括將申請專利範圍第 1 至 9 項中任一項所定義的式 (I) 化合物與該農用化學品組合。