



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公告本

(11)證書號數：TW I504350 B

(45)公告日：中華民國 104 (2015) 年 10 月 21 日

(21)申請案號：100130637

(22)申請日：中華民國 100 (2011) 年 08 月 26 日

(51)Int. Cl. : A01N43/56 (2006.01)

C07D231/10 (2006.01)

A01P3/00 (2006.01)

(30)優先權：2010/09/01 美國 61/378,982

2010/11/23 美國 61/416,346

2011/02/01 美國 61/438,356

2011/07/21 美國 61/510,137

(71)申請人：杜邦股份有限公司 (美國) E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY (US)
美國

(72)發明人：龍 傑佛瑞 凱斯 LONG, JEFFREY KEITH (US)；葛瑞苟瑞 范 GREGORY, VANN (US)；谷特瑞局 史蒂芬 GUTTERIDGE, STEVEN (US)；塔基 安卓 艾德芒 TAGGI, ANDREW EDMUND (US)；柏瑞茲納 詹姆士 法藍斯 BEREZNAK, JAMES FRANCIS (US)

(74)代理人：陳傳岳；郭雨嵐

(56)參考文獻：

CN 1140449A

CN 101796030A

審查人員：蔡榮哲

申請專利範圍項數：24 項 圖式數：0 共 222 頁

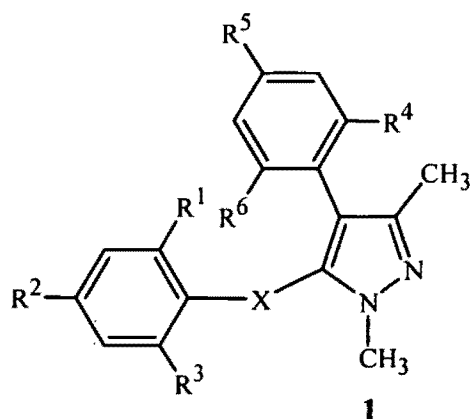
(54)名稱

殺真菌吡唑及其混合物

FUNGICIDAL PYRAZOLES AND THEIR MIXTURES

(57)摘要

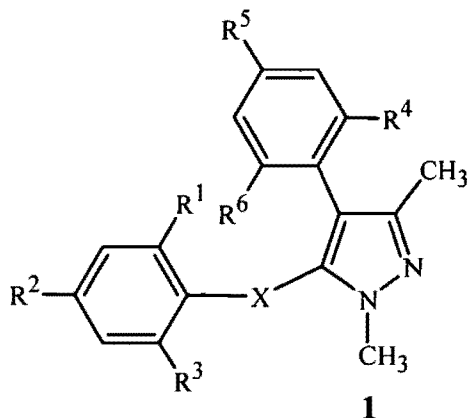
本發明揭露一種殺真菌組成物，其包含(a)至少一種選自式 1 化合物、其 N-氧化物及其鹽之化合物，



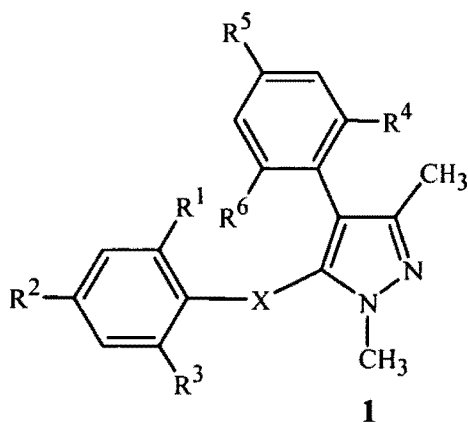
其中 R¹、R²、R³、R⁴、R⁵ 與 R⁶ 係如本揭露中所定義者；以及(b)至少一種額外的殺真菌化合物。本發明亦揭示一種用於防治由真菌類植物病原體造成之植物病害的方法，該方法包含施予該植物或

其部分或該植物種子殺真菌有效量之式 **1** 化合物、其 N-氧化物或其鹽(例如作為前述組成物中之一組分)。本發明所揭示的一種組成物，其包含：(a)至少一種選自上述式 **1** 化合物、其 N-氧化物與其鹽之化合物；以及至少一種無脊椎害蟲防治化合物或藥劑。

Disclosed is a fungicidal composition comprising (a) at least one compound selected from the compounds of Formula **1**, N-oxides, and salts thereof,



wherein R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 and R^6 are as defined in the disclosure; and (b) at least one additional fungicidal compound. Also disclosed is a method for controlling plant diseases caused by fungal plant pathogens comprising applying to the plant or portion thereof, or to the plant seed, a fungicidally effective amount of a compound of Formula **1**, an N-oxide, or salt thereof (e.g., as a component in the aforesaid composition). Also disclosed is a composition comprising: (a) at least one compound selected from the compounds of Formula **1** described above, N-oxides, and salts thereof; and at least one invertebrate pest control compound or agent.



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：100130637

※申請日：100.8.26

※IPC 分類：

A01N 43/56
C07D 231/10
A01P 3/00 (2006.01)

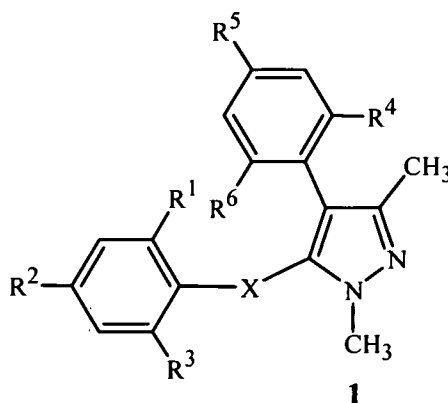
一、發明名稱：(中文/英文)

殺真菌吡唑及其混合物

FUNGICIDAL PYRAZOLES AND THEIR MIXTURES

二、中文發明摘要：

本發明揭露一種殺真菌組成物，其包含(a)至少一種選自式 1 化合物、其 *N*-氧化物及其鹽之化合物，



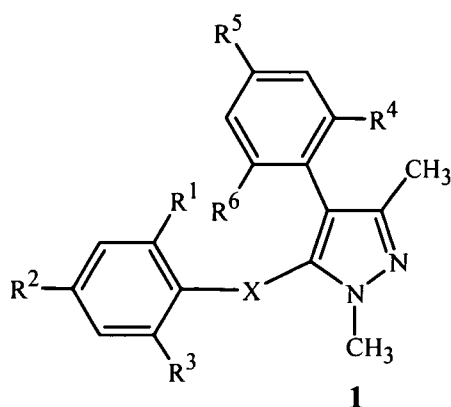
其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 與 R^6 係如本揭露中所定義者；以及(b)至少一種額外的殺真菌化合物。

本發明亦揭示一種用於防治由真菌類植物病原體造成之植物病害的方法，該方法包含施予該植物或其部分或該植物種子殺真菌有效量之式 1 化合物、其 *N*-氧化物或其鹽(例如作為前述組成物中之一組分)。本發明所揭示的一種組成物，其包含：(a)至少一種選自上述式 1

化合物、其 *N*-氧化物與其鹽之化合物；以及至少一種無脊椎害蟲防治化合物或藥劑。

三、英文發明摘要：

Disclosed is a fungicidal composition comprising (a) at least one compound selected from the compounds of Formula 1, *N*-oxides, and salts thereof,



wherein R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 and R^6 are as defined in the disclosure;

and (b) at least one additional fungicidal compound.

Also disclosed is a method for controlling plant diseases caused by fungal plant pathogens comprising applying to the plant or portion thereof, or to the plant seed, a fungicidally effective amount of a compound of Formula 1, an *N*-oxide, or salt thereof (e.g., as a component in the aforesaid composition). Also disclosed is a composition comprising: (a) at least one compound selected from the compounds of Formula 1 described above, *N*-oxides, and

salts thereof; and at least one invertebrate pest control compound or agent.

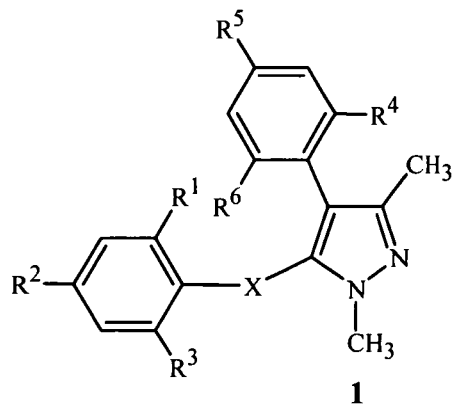
四、指定代表圖：

(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：



六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於某些吡唑衍生物、其 *N*-氧化物及其鹽，並且關於包含此類吡唑衍生物之混合物與組成物以及使用此類吡唑衍生物與其混合物及組成物作為殺真菌劑之方法。

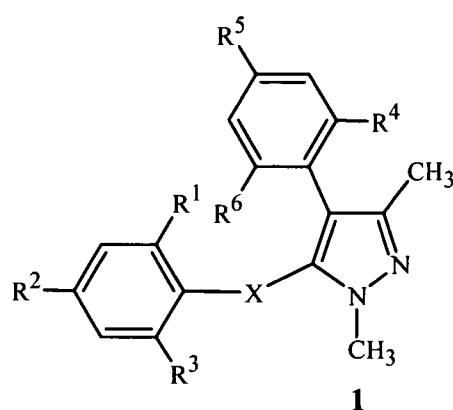
【先前技術】

防治真菌類植物病原造成之植物病害對於達成高作物產率係極為重要的。觀賞作物、蔬菜作物、田間作物、穀類作物以及果實作物之植物病害損害可造成顯著的產量降低及因此導致消費者的花費增加。更由於通常極具破壞性，植物病害可能難以防治且可能對於市售之殺菌劑發展出抗藥性。市面上可以購得許多針對這些用途的產品，但是對於更有效、更價廉、更低毒性、更加環境安全或具有不同作用位點之新式殺真菌化合物仍持續有需求。除了引進新式殺真菌劑外，殺真菌劑之組合物常用於幫助病害防治、擴大防治範圍與減緩抗性發展。更進一步來說，某些罕見的殺菌劑組合物展現了大於加成性的效果(即協同作用)，提供商業上重要的植物病害防治程度。特定殺真菌劑組合物的優點認知會取決於多種因素而改變，例如待處理之特定植物物種或是植物病害，以及植物是在感染植物真菌類病原體之前或之後處理。因此，需要提供新的具優勢之組合物，以提供不同的選擇來最大滿足對特定植物病害的防治需求。這樣的組合物目前已經發現。JP08208620 揭示 *N*-苯吡唑

胺衍生物作為殺蟲劑、除草劑與殺真菌劑；然而本發明之殺真菌吡唑及其混合物並未揭露於此公開文獻中。

【發明內容】

本發明係關於一種殺真菌組成物(即組合物)，其包含(a)至少一種選自式 1 化合物(包括所有立體異構物)、其 *N*-氧化物及其鹽之化合物：



其中

X 為 CHOH、O 或 NH；

R¹ 為鹵素或甲基；

R² 為 H、氰基、鹵素或 C₁-C₂ 烷氧基；

R³ 為 H、鹵素或甲基；

R⁴ 為鹵素；

R⁵ 為 H、氰基、鹵素或 C₁-C₂ 烷氧基；以及

R⁶ 為 H 或鹵素；以及

(b)至少一額外的殺真菌化合物。

本發明亦關於一種組成物，其包含：(a)至少一種選自上述式 1 化合物、其 *N*-氧化物及其鹽之化合物；以及至少一種無脊椎害蟲防治化合物或藥劑。

本發明亦關於一種組成物，其包含其中一種前述組成物，該組成物包含組分(a)以及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑以及液體稀釋劑所組成之群組的額外組分。

本發明亦關於一種用於防治由真菌類植物病原體造成之植物病害的方法，該方法包含對植物或其部分或是植物種子，施予殺真菌有效量之其中一種前述組成物。

前述方法亦可描述為一種用於保護植物或植物種子免於感染由真菌類病原體造成之病害的方法，該方法包含施予一殺真菌有效量之其中一種前述組成物至該植物(或其部分)或植物種子(直接或是透過該植物或植物種子之環境(例如生長介質))。

本發明亦涉及一種上述之式 1 化合物，或一種其 *N*-氧化物或其鹽。本發明進一步涉及一種殺真菌組成物，其包含一式 1 組成物或一其 *N*-氧化物或其鹽，以及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑以及液體稀釋劑所組成之群組的額外組分。本發明亦進一步涉及一種用於保護植物或植物種子免於感染由真菌類病原體造成之病害的方法，該方法包含施予一殺真菌劑有效量之一式 1 組成物或一其 *N*-氧化物或其鹽至該植物或植物種子。

【實施方式】

如本文中所使用，術語「包含」、「包括」、「具有」、「含有」、「特徵為」或其任何其他的變化，係意指在涵蓋非排他性的包含，並受到任何明確表示的限制。例如，包含一系列元素的組成物、混合物、製程或方法不必僅限於該些元素，而是可以包括未明確列出的或該組成物、混合物、製程或方法所固有的其他元素。

連接詞「由……組成」則排除任何未明確說明的元素、步驟或成分。如果是在申請專利範圍中，這樣的用詞將會封閉申請專利範圍，使其除了在通常會與其相關的雜質之外，不包括那些在列舉以外的物質。當連接詞「由……組成」出現在一個請求項的主體子句中，而不是立刻緊接著前言，則該連接詞只限定在前述子句中出現的元素；其他元件並不排除於該項申請專利範圍之整體外。

連接詞「主要由……組成」用於定義包括除了該些字面上所揭露以外的材料、步驟、特徵、成份或元素的組成物或方法，但前提是這些附加的材料、步驟、特徵、成份或元素並不會實質影響申請專利範圍所主張發明的基本和新穎特性。術語「主要由……組成」居於「包含」與「由……組成」之間的中間地帶。

若申請人以開放式用語如「包含」定義一發明或其部分，則表示(除非另有說明)該敘述應解讀為亦以「主要由……所組成」或「由……所組成」描述該發明。

此外，除非有相反的明確說明，「或」是指包含性的「或」，而不是指排他性的「或」。例如，可由下列之任一者滿足條件 A 或 B: A 成立(或存在)且 B 不成立(或不成立)、A 不成立(或不成立)且 B 成立(或存在)以及 A 和 B 兩者皆成立(或存在)。

此外，位於本發明之元素或組分之前的不定冠詞「一」(a 及 an)旨在非限制性地說明該元素或組分的實例數目(即出現數)。因此「一」應理解為包括一個或至少一個，且該元素或組分的單數詞形也包括複數，除非該數目顯然是指單數。

如本揭露內容及申請專利範圍中所提到，「植物」包括植物界的成員，特別是所有生命階段的種子植物(spermatopsida)，包括幼嫩植物(如發芽種子發育成為幼苗)及成熟生殖階段(如產生花及種子的植物)。植物上的部分包括通常在生長介質表面(如土壤)下生長的向地部分，像是根、塊莖、鱗莖和球莖，以及在生長介質上生長的部份，像是葉子(包括莖及葉)、花、果實和種子。

如本文中所提到，術語「幼苗」，無論是單獨使用或與其他字組合，意指從一種子胚芽發育的幼嫩植物。

在上述敘述中，術語「烷氧基」包括如甲氧基與乙氧基。術語「鹵素」包括氟、氯、溴或碘。

在一取代基基團中之碳原子總數係以「C_i-C_j」前綴語來指示，其中 i 與 j 為 1 至 2 之數字。

關於該發明組成物與方法之化合物可存在為一或多種立體異構物。各種立體異構物包括鏡像異構物、非鏡像異構物、阻轉異構物和幾何異構物。熟習該項技術

者將明瞭，一個立體異構物當相對於其他立體異構物經濃化或當從其他立體異構物經分離出時，可能活性更高及/或可能展示出有益的效果。此外，該熟習該項技術者知道如何分離、濃化及/或選擇性地製備所述立體異構物。在此發明組成物中之化合物可存在為一立體異構物之混合物、個別立體異構物或一光學活性形式。

用於製備雜環(例如吡唑)之 *N*-氧化物的合成方法係熟習該項技術者所極為熟知者，其包括以過氧酸氧化雜環，過氧酸如過氧乙酸與間氯過氧苯甲酸(MCPBA)、過氧化氫、烷基氫過氧化物(例如氫過氧化三級丁基)、過硼酸鈉與雙環氧乙烷(例如二甲基雙環氧乙烷)。這些製備 *N*-氧化物的方法已在文獻中被廣泛描述及回顧，例如請參見：T. L. Gilchrist 於 *Comprehensive Organic Synthesis*，第 7 卷，第 748 - 750 頁，S.V. Ley 編輯，Pergamon Press；M. Tisler 與 B. Stanovnik 於 *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*，第 3 卷，第 18 - 20 頁，A. J. Boulton 與 A. McKillop 編輯，Pergamon Press；M. R. Grimmett 及 B. R. T. Keene 於 *Advances in Heterocyclic Chemistry*，第 43 卷，第 149 - 161 頁，A. R. Katritzky 編輯，Academic Press；M. Tisler 與 B. Stanovnik 於 *Advances in Heterocyclic Chemistry*，第 9 卷，第 285 - 291 頁，A. R. Katritzky 與 A. J. Boulton 編輯，Academic Press；G. W. H. Cheeseman 與 E. S. G. Werstiuk 於 *Advances in Heterocyclic Chemistry*，第 22 卷，第 390 - 392 頁 A. R. Katritzky 與 A. J. Boulton 編輯，Academic Press。

熟習該項技術者會瞭解到，因為化合物的鹽類與它們對應的非鹽形式在環境和生理條件下會處於平衡狀態，所以鹽類會分享非鹽形式的生物效用。因此，廣泛而多種不同的式 1 之單獨以及混合物中之化合物鹽類對於防治由真菌類植物病原體所造成的植物病害是有效的(即是農業上適用的)。式 1 化合物之鹽包括以無機或有機酸加成之酸加成鹽，例如氫溴酸、鹽酸、硝酸、磷酸、硫酸、乙酸、丁酸、反丁烯二酸、乳酸、順丁烯二酸、丙二酸、草酸、丙酸、水楊酸、酒石酸、4-甲苯磺酸或戊酸。因此，本發明係關於選自式 1、其 *N*-氧化物及其農業上適合鹽之化合物的混合物。

選自式 1、其立體異構物、其互變異構物、其 *N*-氧化物及其鹽之化合物，典型為以超過一種形式存在，並且式 1 因而包括式 1 代表化合物之所有結晶與非結晶形式。非結晶形式包括像是蠟和膠的固體實施例，也包括像是溶液和熔體的液體實施例。結晶形式包括代表主要為單一晶體類型之實施例以及代表一多形體(即不同的結晶類型)之混合物的實施例。術語「多形體」意指一可以結晶成不同結晶形式之化合物的特定晶形，這些形式的晶格內分子有不同的排列及/或構形。雖然多形體可以有同樣的化學組成，它們也可以在組成上因為共結晶水或其他分子的存在或不存在而不同，該共結晶水或其他分子可以弱結合或強結合在晶格內。多形體可以在化學、物理和生物特性有所不同，像是晶體形狀、密度、硬度、顏色、化學穩定性、熔點、吸濕性、懸浮率、溶解速率和生物利用度。熟習該項技術者將瞭解到由式

1 所代表化合物之一多形體，相對於式 1 所代表同樣化合物之其他多形體或是多形體的混合物可展現有益之效果(例如適合於製備有用的製劑以改善生物利用效果)。製備或分離由式 1 所代表化合物之一特定多形體可藉由熟習該項技術者所通曉的方法來達成，例如，利用選定的溶劑及溫度來進行結晶。

如本發明內容中所述，本發明之一態樣係關於一組成物，其包含(a)至少一種選自式 1、其 *N*-氧化物及其鹽之化合物，以及(b)至少一種額外殺真菌化合物。更特定而言，組分(b)係選自由下列所組成之群組：

- (b1) 苯并咪唑胺甲酸甲酯(MBC)類殺真菌劑；
- (b2) 二羧醯亞胺類(dicarboximide)殺真菌劑；
- (b3) 去甲基作用抑制劑(DMI)類殺真菌劑；
- (b4) 苯醯胺類殺真菌劑；
- (b5) 胺/嗎啉(amine/morpholine)類殺真菌劑；
- (b6) 磷脂質生合成抑制劑類殺真菌劑；
- (b7) 羧醯胺類(carboxamide)殺真菌劑；
- (b8) 羥基(2-胺基-)嘧啶類殺真菌劑；
- (b9) 苯胺嘧啶類殺真菌劑；
- (b10) *N*-苯基胺甲酸酯類殺真菌劑；
- (b11) 醌外抑制劑(QoI)類殺真菌劑；
- (b12) 苯基吡咯類殺真菌劑；
- (b13) 喹啉類殺真菌劑；
- (b14) 脂質過氧化抑制劑類殺真菌劑；
- (b15) 黑色素生合成抑制劑-還原酶(MBI-R)類殺真菌劑；

- (b16) 黑色素生合成抑制劑-脫水酶(MBI-D)類殺真菌劑；
- (b17) 羥基苯胺類殺真菌劑；
- (b18) 鯊烯-環氧酶抑制劑類殺真菌劑；
- (b19) 多氧菌素類(polyoxin)殺真菌劑；
- (b20) 苯脲類殺真菌劑；
- (b21) 醌內抑制劑(QiI)類殺真菌劑；
- (b22) 苯甲醯胺類殺真菌劑；
- (b23) 哌喃糖醛酸(enopyranuronic acid)抗生素類殺真菌劑；
- (b24) 六碳糖哌喃糖苷基(hexopyranosyl)抗生素類殺真菌劑；
- (b25) 葡萄糖哌喃糖苷基(glucopyranosyl)抗生素：蛋白質合成類殺真菌劑；
- (b26) 葡萄糖哌喃糖苷基抗生素：繭蜜糖酶及肌醇生合成殺真菌劑；
- (b27) 氰乙醯胺肟類(cyanoacetamideoxime)殺真菌劑；
- (b28) 胺基甲酸酯類殺真菌劑；
- (b29) 氧化磷酸化解偶合類殺真菌劑；
- (b30) 有機錫類殺真菌劑；
- (b31) 羧酸類殺真菌劑；
- (b32) 雜芳香族類殺真菌劑；
- (b33) 膦酸鹽類殺真菌劑；
- (b34) 鄰胺甲醯苯甲酸類殺真菌劑；
- (b35) 苯并三吡 (benzotriazine)殺真菌劑；

- (b36) 苯-磺醯胺類殺真菌劑；
- (b37) 嗒吡酮類(pyridazinone)殺真菌劑；
- (b38) 噻吩-羧醯胺類殺真菌劑；
- (b39) 嘧啶醯胺類殺真菌劑；
- (b40) 羧酸醯胺(CAA)類殺真菌劑；
- (b41) 四環素類抗生素殺真菌劑；
- (b42) 硫胺甲酸酯類殺真菌劑；
- (b43) 苯甲醯胺類殺真菌劑；
- (b44) 誘發寄主植物防禦類殺真菌劑；
- (b45) 多重位點接觸活性類殺真菌劑；
- (b46) 非組分(a)及組分(b1)至(b45)殺真菌劑的殺真菌劑；以及

化合物(b1)至(b46)的鹽類。

值得注意的是其中組分(b)包含至少一種殺真菌化合物之實施例，該殺真菌化合物來自選自(b1)至(b46)之兩個不同群組的各個群組。

「苯并咪唑胺基甲酸甲酯(MBC)類殺真菌劑(b1)」(FRAC(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會，Fungicide Resistance Action Committee)代碼 1)藉由在微管組合期間結合至 β -微管蛋白抑制有絲分裂。抑制微管組合可阻斷細胞分裂、細胞以及細胞結構內之傳輸。苯并咪唑胺基甲酸甲酯殺真菌劑包括苯并咪唑類以及多保淨(硫脲甲酸類，thiophanate)類殺真菌劑。該苯并咪唑類包括免賴得(benomyl)、貝芬替(carbendazim)、麥穗寧(fuberidazole)以及腐絕(thiabendazole)。該多保淨類包括多保淨以及甲基多保淨(thiophanate-methyl)。

已提出「二羧醯亞胺類(dicarboximide)殺真菌劑(b2)」(FRAC 代碼 2)來透過干擾 NADH 細胞色素 c 還原酶而抑制真菌中的脂質過氧化作用。實例包括克氯得(chlozolate)、依普同(iprodione)、撲滅寧(procymidone)以及免克寧(vinclozolin)。

「去甲基作用抑制劑(DMI)類殺真菌劑(b3)」(FRAC 代碼 3)抑制固醇產生中具有重要地位的 C14-去甲基酶。固醇(如麥角固醇)為膜結構及機能所需，因而為機能細胞壁生長發育之必要物質。因此，曝露於這些殺真菌劑中會造成易感真菌的不正常生長並最終導致死亡。DMI 殺真菌劑係可分為數種化學分類：唑類(包括三唑類以及咪唑類)、嘧啶類、哌嗪(piperazine)類以及吡啶類。該三唑類包括阿扎康唑(azaconazole)、比多農(bitertanol)、溴克座(bromuconazole)、環克座(cyproconazole)、待克利(difenoconazole)、達克利(diniconazole)(包括達克利-M)、依普座(epoxiconazole)、乙環唑(etaconazole)、芬克座(fenbuconazole)、氟喹唑(fluquinconazole)、護矽得(flusilazole)、護汰芬(flutriafol)、菲克利(hexaconazole)、易胺座(imibenconazole)、種菌唑(ipconazole)、滅特座(metconazole)、邁克尼(myclobutanil)、平克座(penconazole)、普克利(propiconazole)、丙硫菌唑(prothioconazole)、奎因克座(quinconazole)、矽氟唑(simeconazole)、得克利(tebuconazole)、四克利(tetraconazole)、三泰芬(triadimefon)、三泰隆(triadimenol)、滅菌唑(triticonazole)及單克素

(uniconazole)。該咪唑類包括克霉唑(clotrimazole)、益康唑(econazole)、依滅列(imazalil)、異康唑(isoconazole)、咪康唑(miconazole)、惡咪唑(oxpoconazole)、撲克拉(prochloraz)、披扶座(pefurazoate)及賽福座(triflumizole)。該嘧啶類包括芬瑞莫(fenarimol)、尼瑞莫(nuarimol)及嘧菌醇(triarimol)。該哌咩類包括賽福寧(triforine)。該吡啶類包括得滅多(buthiobate)及比芬諾(pyrifenox)。生化研究顯示上述所有殺真菌劑皆為 DMI 殺真菌劑，如 K. H. Kuck 等人於 *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr (Ed.) , Gustav Fischer Verlag : New York , 1995 , 205-258 中所述。

「苯醯胺類殺真菌劑(b4)」(FRAC 代碼 4)是卵菌類真菌中 RNA 聚合酶的特定抑制劑。曝露於這些殺真菌劑中的易感性真菌顯示其將尿苷結合至 rRNA 之能力降低。藉由曝露於此類殺真菌劑可防止易感真菌之生長以及發育。苯醯胺類殺真菌劑包括醯丙胺酸(acylalanine)類、噁唑啉酮(oxazolidinone)類及丁內酯類殺真菌劑。該醯丙胺酸類包括本達樂(benalaxyl)、右本達樂(benalaxyl-M)、呋霜靈(furalaxyl)、滅達樂(metalaxyl)、滅達樂-M(亦已知為右滅達樂)。該噁唑啉酮類包括毆殺斯(oxadixyl)。該丁內酯類包括呋醯胺(ofurace)。

「胺/嗎啉類殺真菌劑(b5)」(FRAC 代碼 5)抑制在固醇類生合成途徑內的兩個標靶位點， $\Delta^8 \rightarrow \Delta^7$ 異構酶以及 Δ^{14} 還原酶。固醇(如麥角固醇)為膜結構及機能所需，為機能細胞壁發育之必要物質。因此，曝露於這些

殺真菌劑將使易感真菌產生異常成長，最終死亡。該胺/嗎啉類殺真菌劑(又稱為非 DMI 固醇生合成抑制劑)包括嗎啉類、哌啶以及螺縮酮-胺殺真菌劑。該嗎啉類包括愛地福(aldimorph)、十二環嗎啉(dodemorph)、芬普福(fenpropimorph)、三得芬(tridemorph)以及三芬醯胺(trimorphamide)。該哌啶類包括苯鏽啶(fenpropidin)以及粉病靈(piperalin)。該螺縮酮胺類包括甚孢菌素(spiroxamine)。

「磷脂質生合成抑制劑類殺真菌劑(b6)」(FRAC 代碼 6)藉由影響磷脂質生合成來抑制真菌生長。磷脂生合成殺真菌劑包括硫代磷酸酯(phosphorothiolate)及二硫噻(dithiolane)殺真菌劑。該硫代磷酸酯包括護粒松(edifenphos)、丙基喜樂松(iprobenfos)以及白粉松(pyrazophos)。該二硫噻類包括亞賜圃(isoprothiolane)。

「羧醯胺類殺真菌劑(b7)」(FRAC 代碼 7)藉由阻斷克氏循環(TCA cycle)中稱為琥珀酸脫氫酶的關鍵酵素來抑制複合體 II(琥珀酸脫氫酶)真菌呼吸作用。抑制呼吸作用可防止真菌製造 ATP，從而抑制成長以及繁殖。羧醯胺殺真菌劑包括苯甲醯胺(benzamide)、呋喃羧醯胺(furan carboxamide)、噁噻羧醯胺(oxathiin carboxamide)、噻唑羧醯胺(thiazole carboxamide)、吡唑羧醯胺(pyrazole carboxamide)及吡啶羧醯胺(pyridine carboxamide)。該苯甲醯胺類包括麥鏽靈(benodanil)、福多寧(flutolanil)以及滅普寧(mepronil)。該呋喃羧醯胺包括甲呋醯胺(fenfuram)。該噁噻羧醯胺包括萎鏽靈(carboxin)以及嘉保信

(oxycarboxin)。該噻唑羧醯胺包括賽氟滅(thifluzamide)。該吡唑羧醯胺包括必殺芬(bixafen)、福拉比(furametpyr)、異吡聯(isopyrazam)、福熱殺(fluxapyroxad)、吡噻菌胺(penthiopyrad)、環丙吡菌胺(sedaxane)(*N*-[2-(1*S*,2*R*)-[1,1'-雙環丙基]-2-基苯基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-羧醯胺)與派福芬(penflufen)(*N*-[2-(1,3-二甲丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-羧醯胺)(PCT 專利公開第 WO 2003/010149 號)。該吡啶羧醯胺包括白克列(boscalid)。

「羥基(2-胺基-)嘧啶類殺真菌劑(b8)」(FRAC 代碼 8)藉由干擾腺苷去胺酶來抑制核酸合成。實例包括布瑞莫(bupirimate)、二甲依瑞莫(dimethirimol)以及依瑞莫(ethirimol)。

已提出「苯胺嘧啶類殺真菌劑(b9)」(FRAC 代碼 9)以抑制胺基酸甲硫胺酸之生合成以及阻斷在感染過程中溶解植物細胞的水解酶分泌。實例包括賽普洛(cyprodinil)、滅派林(mepanipyrim)以及派美尼(pyrimethanil)。

「*N*-苯基胺甲酸酯類殺真菌劑(b10)」(FRAC 代碼 10)藉由結合至 β -微管蛋白與阻斷微管組合來抑制有絲分裂。抑制微管組合可阻斷細胞分裂、細胞以及細胞結構內傳輸。實例包括乙霉威(diethofencarb)。

「醌外抑制(QoI)類殺真菌劑(b11)」(FRAC 代碼 11)藉由影響泛醌氧化酶(ubiquinol oxidase)來抑制真菌中複合體 III 粒線體的呼吸作用。泛醌氧化被阻斷於細胞色素 bc_1 複合體「醌外」(Q_o)位點，其位於真菌之內粒

線體膜中。抑制粒線體呼吸作用可防止正常真菌成長以及發育。醃外抑制劑類殺真菌劑包括甲氧丙烯酸酯(methoxyacrylate)、甲氧胺基甲酸酯(methoxycarbamate)、羥亞胺基乙酸酯(oximinoacetate)、羥亞胺基乙醯胺(oximinoacetamide)與二氫二𪗇𪗇(dihydrodioxazine)殺真菌劑(亦統稱為嗜球果傘素(strobilurin)類殺真菌劑)以及𪗇唑啉二酮(oxazolidinedione)、咪唑啉酮(imidazolinone)與苯甲基胺基甲酸酯(benzylcarbamate)類殺真菌劑。該甲氧丙烯酸酯類包括亞托敏(azoxystrobin)、烯肱菌酯(enestroburin)(SYP-Z071)以及𪗇氧菌酯(picoxystrobin)。該甲氧胺基甲酸酯類包括百克敏(pyraclostrobin)及唑胺菌酯(pyrametostrobin)。該羥亞胺基乙酸酯類包括克收欣(kresoxim-methyl)、唑菌酯(pyraoxystrobin)及三氟敏(trifloxystrobin)。該羥亞胺基乙醯胺類包括醚菌胺(dimoxystrobin)、苯氧菌胺(metominostrobin)、肱醚菌胺(orysastrobin)與 α -(甲氧亞胺基)-*N*-甲基-2-[[[1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基]亞胺基]甲基]苯乙醯胺。該二氫二𪗇𪗇包括氟嘧菌酯(fluxastrobin)。該𪗇唑啉二酮包括凡殺同(fluxastrobin)。該咪唑啉酮包括咪唑菌酮(fenamidone)。該苯甲基胺基甲酸酯包括防霉丹(pyribencarb)。

「苯基吡咯類殺真菌劑(b12)」(FRAC 代碼 12)抑制與真菌中與滲透訊息傳遞有關的一個 MAP 蛋白質激

酶。拌種咯(Fenpiclonil)以及護汰寧(fludioxonil)為此類殺真菌劑之實例。

已提出「喹啉類殺真菌劑(b13)」(FRAC 代碼 13)可藉由影響在早期細胞訊息傳遞中的 G 蛋白來抑制訊息傳遞。已顯示它們干擾真菌(造成白粉病)的萌芽與/或附著器(appressorium)形成。快諾芬(quinoxifen)為此類殺真菌劑之實例。

已提出「脂質過氧化作用抑制劑類殺真菌劑(b14)」(FRAC 代碼 14)可用於抑制脂質過氧化作用，該過氧化作用影響真菌中的細胞膜合成。此類殺真菌劑之成員(如依得利(etridiazole))亦可能影響其他生物過程，例如呼吸作用以及黑色素之生合成。脂質過氧化作用殺真菌劑包括芳族碳以及 1,2,4-噻二唑殺真菌劑。該芳香族碳包括聯苯、二氯甲氧苯二氯甲氧苯(chloroneb)、大克爛(dicloran)、五氯硝苯(quintozene)、四氯硝基苯(tecnazene)以及脫克松(tolclofos-methyl)。1,2,4-噻二唑包括依得利(etridiazole)。

「黑色素生合成抑制劑-還原酶(MBI-R)類殺真菌劑(b15)」(FRAC 代碼 16.1)抑制黑色素生合成中萘亞甲基還原(naphthal reduction)步驟。黑色素為某些真菌感染宿主植物所必須。黑色素生合成抑制劑-還原酶類殺真菌劑包括異苯并呋喃酮(isobenzofuranone)類、吡咯并喹啉(pyrroloquinolinone)類以及三唑苯并噻唑(triazolobenzothiazole)類殺真菌劑。該異苯并呋喃酮類包括熱必斯(fthalide)。該吡咯并喹啉類包括百快隆

(pyroquilon)。該三唑苯并噻唑類包括三賽唑(tricyclazole)。

「黑色素生合成抑制劑-脫水酶(MBI-D)類殺真菌劑(b16)」(FRAC 代碼 16.2)抑制黑色素生合成中之小柱孢酮(scytalone)脫水酶。黑色素為某些真菌感染宿主植物所必須。黑色素生合成抑制物-脫水酶殺真菌劑包括環丙烷羧醯胺、羧醯胺以及丙醯胺殺真菌劑。該環丙烷羧醯胺包括加普胺(carpropamid)。該羧醯胺包括雙氯氰菌胺(diclocymet)。該丙醯胺包括芬諾尼(fenoxanil)。

「羥基苯胺類殺真菌劑(b17)」(FRAC 代碼 17)抑制在固醇產生中具有重要地位的 C4-去甲基酶。實例包括環醯菌胺(fenhexamid)。

「鯊烯-環氧酶抑制劑類殺真菌劑(b18)」(FRAC 代碼 18)在麥角固醇生合成途徑中抑制鯊烯-環氧酶。固醇(如麥角固醇)為膜結構及機能所需，為機能細胞壁發育之必要物質。因此曝露於此些殺真菌劑會導致不正常的生長以及易感性真菌的逐漸死亡。鯊烯-環氧酶抑制劑類殺真菌劑包括硫胺甲酸酯(thiocarbamate)以及烯丙基胺(allylamine)殺真菌劑。該硫胺甲酸酯包括稗草畏(pyributicarb)。該烯丙基胺包括納芙迪芬(naftifine)以及特比萘酚(terbinafine)。

「多氧菌素類殺真菌劑(b19)」(FRAC 代碼 19)抑制幾丁質合成酶。實例包括多氧菌素(polyoxin)。

已提出「苯脲類殺真菌劑(b20)」(FRAC 代碼 20)用於影響細胞分裂。實例包括賓克隆(pencycuron)。

「醌內抑制劑(QiI)類殺真菌劑(b21)」(FRAC 代碼 21)藉由影響泛醌還原酶來抑制真菌中複合體 III 粒線體呼吸作用。泛醌的還原被阻斷於細胞色素 bc_1 複合體「醌內」(Q_i)位置，其位於真菌內粒線體膜。抑制粒線體呼吸可防止正常真菌成長以及發育。醌內抑制劑類殺真菌劑包括氰咪唑(cyanoimidazole)以及鄰磺醯胺三唑類(sulfamoyltriazole)殺真菌劑。該氰咪唑包括賽座滅(cyazofamid)。該鄰磺醯胺三唑類殺真菌劑包括安美速(amisulbrom)。

「苯甲醯胺類殺真菌劑(b22)」(FRAC 代碼 22)藉由結合 β -微管蛋白與阻斷微管組合來抑制有絲分裂。抑制微管組合可阻斷細胞分裂、細胞以及細胞結構內傳輸。實例包括座賽胺(zoxamide)。

「哌喃糖醛酸抗生素類殺真菌劑(b23)」(FRAC 代碼 23)藉由影響蛋白質生合成來抑制真菌生長。實例包括保米黴素(blasticidin-S)。

「六碳糖哌喃糖苷基抗生素類殺真菌劑(b24)」(FRAC 代碼 24)藉由影響蛋白質生合成抑制真菌生長。實例包括嘉賜黴素(kasugamycin)。

「葡萄糖哌喃糖苷基抗生素：蛋白質合成類殺真菌劑(b25)」(FRAC 代碼 25)藉由影響蛋白質生合成抑制真菌生長。實例包括鏈黴素(streptomycin)。

「葡萄糖哌喃糖苷基糖抗生素：繭蜜糖酶(trehalase)以及肌醇生合成類殺真菌劑(b26)」(FRAC 代碼 26)抑制肌醇生合成途徑中之繭蜜糖酶。實例包括維利黴素(validamycin)。

「氧乙醯胺肟類殺真菌劑(b27)」(FRAC 代碼 27)包括克絕(cymoxanil)。

「胺基甲酸酯類殺真菌劑(b28)」(FRAC 代碼 28)被認為是真菌生長的多位點抑制劑。其可干擾細胞膜中之脂肪酸合成，其之後阻斷細胞膜滲透性。普拔克(Propamacarb)、愛得寶(iodocarb)與胺丙威(prothiocarb)是此類殺真菌劑的實例。

「氧化磷酸化解偶合類殺真菌劑(b29)」(FRAC 代碼 29)藉由解偶合氧化磷酸化抑制真菌呼吸作用。抑制呼吸作用會防止真菌正常成長以及發育。此類包括 2,6-二硝苯胺如扶吉胺(fluazinam)、嘧啶酮脒(pyrimidonehydrazone)如富米綜(ferimzone)以及二硝苯基巴豆酸酯如白粉克(dinocap)、氧乙酸基白粉克(meptyldinocap)以及百蟠克(binapacryl)。

「有機錫類殺真菌劑(b30)」(FRAC 代碼 30)於氧化磷酸化途徑中抑制三磷酸腺苷(ATP)合成酶。實例包括三苯醋錫(fentin acetate)、三苯氯錫(fentin chloride)以及三苯羥錫(fentin hydroxide)。

「羧酸類殺真菌劑(b31)」(FRAC 代碼 31)藉由影響去氧核糖核酸(DNA)第二型拓撲異構酶(旋轉酶)來抑制真菌生長。實例包括歐索林酸(oxolinic acid)。

「雜芳族類殺真菌劑(b32)」(FRAC 代碼 32)經提出會影響 DNA/核糖核酸(RNA)合成。雜芳族類殺真菌劑包括異𪗇唑(isoxazole)以及異噻唑酮(isothiazolone)殺真菌劑。異𪗇唑包括殺紋寧(hymexazole)，而異噻唑酮包括辛噻酮(octhilinone)。

「磷酸鹽類殺真菌劑(b33)」(FRAC 代碼 33)包括亞磷酸以及其多種鹽類，包括福賽得(fosetyl-aluminum)。

「鄰胺甲醯苯甲酸類殺真菌劑(b34)」(FRAC 代碼 34)包括克枯爛(teclofthalam)。

「苯并三吡類殺真菌劑(b35)」(FRAC 代碼 35)包括咪唑嗪(triazoxide)。

「苯-磺醯胺類殺真菌劑(b36)」(FRAC 代碼 36)包括氟硫滅(flusulfamide)。

「噁吡酮類殺真菌劑(b37)」(FRAC 代碼 37)包括達滅淨(diclomezine)。

已提出「噻吩-羧醯胺類殺真菌劑(b38)」(FRAC 代碼 38)用於影響 ATP 產生。實例包括矽噻菌胺(silthiofam)。

「嘧啶醯胺類殺真菌劑(b39)」(FRAC 代碼 39)藉由影響磷脂質生合成來抑制真菌的生長並且包含二氟林(diflumetorim)。

已提出「羧酸醯胺(CAA)類殺真菌劑(b40)」(FRAC 代碼 40)用於抑制磷脂質生合成以及細胞壁沉積。抑制此等程序可防止目標真菌成長並導致其死亡。羧酸醯胺類殺真菌劑包括肉桂酸醯胺、纈胺醯胺胺基甲酸酯(valinamide carbamate)以及苦杏仁酸醯胺殺真菌劑。該肉桂酸醯胺包括達滅芬(dimethomorph)以及氟嗎啉(flumorph)。該纈胺醯胺胺基甲酸酯包括苯噻菌胺(benthiavalicarb)、苯噻菌胺-異丙基(benthiavalicarb-isopropyl)、丙森鋅(iprovalicarb)及瓦芬耐(valifenalate)(valiphenal)。苦杏仁酸醯胺包括曼普胺

(mandipropamid)、*N*-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧基]-3-甲氧苯基]乙基]-3-甲基-2-[(甲磺醯基)胺基]丁醯胺以及 *N*-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧基]-3-甲氧苯基]乙基]-3-甲基-2-[(乙磺醯基)胺基]丁醯胺。

「四環素抗生素類殺真菌劑(b41)」(FRAC 代碼 41)藉由影響複合體 1 菸鹼醯胺腺嘌呤二核苷酸(NADH)氧化還原酶來抑制真菌生長。實例包括氧四環素(oxytetracycline)。

「硫胺甲酸酯類殺真菌劑(b42)」(FRAC 代碼 42)包括減速克(methasulfocarb)。

「苯甲醯胺類殺真菌劑(b43)」(FRAC 代碼 43)藉由類血影(spectrin-like)蛋白質的非定域化作用來抑制真菌生長。實例包括氟啞醯菌胺(acylpicolide)殺真菌劑如氟比來(fluopicolide)以及氟吡菌醯胺(fluopyram)。

「誘發寄主植物防禦類殺真菌劑(b44)」(FRAC 代碼 P)誘發寄主植物防禦機制。誘發寄主植物防禦類殺真菌劑包括苯并噻二唑(benzo-thiadiazole)、苯并異噻唑(benzisothiazole)以及噻二唑-羧醯胺(thiadiazole-carboxamide)殺真菌劑。該苯并噻二唑類包括阿拉酸式苯-S-甲基(acibenzolar-S-methyl)。該苯并異噻唑包括撲殺熱(probenazole)。該噻二唑-羧醯胺包括噻醯菌胺(tiadinil)以及異噻菌胺(isotianil)。

「多重位點接觸類殺真菌劑(b45)」透過多作用位點來抑制真菌生長並且具有接觸/預防性活性。此類殺真菌劑包括：「銅類殺真菌劑(b45.1) (FRAC 代碼 M1)」、「硫類殺真菌劑(b45.2) (FRAC 代碼 M2)」、「二硫胺甲酸酯

類殺真菌劑(b45.3) (FRAC 代碼 M3)」、「酞醯亞胺類殺真菌劑(b45.4) (FRAC 代碼 M4)」、「氯腈(chloronitrile)類殺真菌劑(b45.5) (FRAC 代碼 M5)」、「磺醯胺類殺真菌劑(b45.6) (FRAC 代碼 M6)」、「胍類殺真菌劑(b45.7) (FRAC 代碼 M7)」、「三吡類殺真菌劑(b45.8) (FRAC 代碼 M8)」以及「醌類殺真菌劑(b45.9) (FRAC 代碼 M9)」。「銅類殺真菌劑」是含銅的無機化合物，典型為二價氧化銅狀態；實例中包括氯氧化銅、硫酸銅以及氫氧化銅，其包括組成物例如波多(Bordeaux)混合液(三元硫酸銅)。「硫類殺真菌劑」是包含硫原子環或鏈的無機化學物質；實例包括元素硫。「二硫胺甲酸酯類殺真菌劑」含有一個二硫胺甲酸酯之分子基團(moiety)；實例包括鋅錳乃浦(mancozeb)、免得爛(metiram)、甲基鋅乃浦(propineb)、富爾邦鐵(ferbam)、錳乃浦(maneb)、得恩地(thiram)、鋅乃浦(zineb)以及福美鋅(ziram)。「酞醯亞胺類殺真菌劑」包括一個酞醯亞胺類之分子基團；實例包括福爾培(folpet)、蓋普丹(captan)以及四氯丹(captafol)。「氯氰類殺真菌劑」包括一個以氯及氰基取代的芳環；實例包括四氯異苯腈(chlorothalonil)。「磺醯胺類殺真菌劑」包括益發靈(dichlofluanid)以及甲基益發靈(tolylfluanid)。「胍類殺真菌劑」包括多寧(dodine)、克熱淨(guazatine)以及雙胍辛胺(iminoctadine)。「三吡類殺真菌劑」包括敵菌靈(anilazine)。「醌類殺真菌劑」包括腈硫醌(dithianon)。

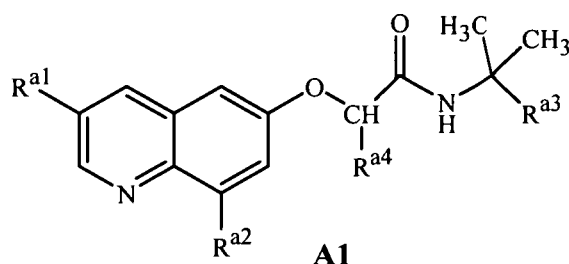
「非組分(a)以及組分(b1)到(b45)；(b46)殺真菌劑的殺真菌劑」包括某些作用機轉尚不明瞭的殺真菌劑。

這些包括：(b46.1)「噻唑羧醯胺類殺真菌劑」(FRAC 代碼 U5)、(b46.2)「苯基-乙醯胺類殺真菌劑」(FRAC 代碼 U6)、(b46.3)「喹唑啉酮(quinazolinone)類殺真菌劑」(FRAC 代碼 U7)、(b46.4)「二苯基酮類殺真菌劑」(FRAC 代碼 U8) 與 (b46.5)「三唑并嘧啶胺(triazolopyrimidylamine)類殺真菌劑」(FRAC 代碼 45)。

該噻唑羧醯胺類包括噻唑菌胺(ethaboxam)。該苯基乙酸醯胺類包括賽芬胺(cyflufenamid)以及 *N*-[[[(環丙甲氧基)胺基]][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]-亞甲基]苯乙醯胺。該喹唑啉酮類包括丙氧喹啉(proquinazid)以及 2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4*H*-1-苯并嘧啶-4-酮。該二苯基酮類包括滅芬農(metrafenone)及派芬農(pyriofenone)。該三唑并嘧啶胺類包括辛唑嘧菌胺(ametoctradin)，並且據信其可藉由結合至一在泛醌-細胞色素 *bcl* 還原酶上的不明位點來抑制複合體 III 之粒線體呼吸作用。該(b46)類藥劑亦可包括比托沙(bethoxazin)、新阿蘇仁(neo-asozin)(鐵甲砷酸銨)、胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)、吡咯菌素(pyrrolnitrin)、滅蟎蟪(quinomethionate)、泰伏勤(tebufloquin)、2-[[2-氟-5-(三氟甲基)苯基]硫基]-2-[3-(2-甲氧苯基)-2-亞四氫噻唑基]乙腈、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基-3-異噁唑啉基]吡啶、*N*-[1-[[[1-(4-氟苯基)乙基]磺醯基]甲基]丙基]胺基甲酸 4-氟苯酯、5-氯-6-(2,4,6-三氟苯基)-7-(4-甲吡啶-1-基)[1,2,4]三唑[1,5-*a*]嘧啶、*N*-(4-氯-2-硝苯基)-*N*-乙基-4-甲苯磺醯胺、*N'*-[4-[4-氯-3-(三氟甲基)苯氧基]-2,5-二甲苯基]-*N*-乙基-*N*-雙甲脒

(*N'*-[4-[4-chloro-3-(trifluoromethyl)phenoxy]-2,5-dimethylphenyl]-*N*-ethyl-*N*-methylethanimidamide)與 1-[(2-丙烯硫基)羰基]-2-(1-甲基乙基)-4-(2-甲苯基)-5-胺-1*H*-吡唑-3-酮。

「非組分(a)與組分(b1)至(b45)；(b46)殺真菌劑之殺真菌劑」亦包括(b46.5)式 A1 之 6-喹啉氧乙醯胺化合物及其鹽



其中

R^{a1} 為鹵素、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 炔基；

R^{a2} 為 H、鹵素或 C_1 - C_4 烷基；

R^{a3} 為 C_1 - C_{12} 烷基、 C_1 - C_{12} 鹵烷基、 C_1 - C_{12} 烷氧基、 C_2 - C_{12} 烷氧烷基、 C_2 - C_{12} 烯基、 C_2 - C_{12} 炔基、 C_4 - C_{12} 烷氧烯基、 C_4 - C_{12} 烷氧炔基、 C_1 - C_{12} 烷硫基或 C_2 - C_{12} 烷硫烷基；

R^{a4} 為甲基或 Y^{a1} - R^{a5} ；

R^{a5} 為 C_1 - C_2 烷基；以及

Y^{a1} 為 CH_2 、O 或 S。

式 A1 化合物、其作為殺真菌劑之使用與製備方法係眾所皆知；請參見如 PCT 專利公開案第 WO

2004/047538 號、WO 2004/108663 號、WO 2006/058699 號、WO 2006/058700 號、WO 2008/110355 號、WO 2009/030469 號、WO 2009/049716 以及 WO 2009/087098 號。式 A1 化合物之實例包括：2-[(3-溴-6-喹啉基)氧基]-N-(1,1-二甲基-2-丁炔-1-基)-2-(甲硫基)乙醯胺、N-(1,1-二甲基-2-丁炔-1-基)-2-[(3-乙炔基-6-喹啉基)氧基]-2-(甲硫基)乙醯胺、2-[(3-溴-8-甲基-6-喹啉基)氧基]-N-(1,1-二甲基-2-丙炔-1-基)-2-(甲硫基)乙醯胺與 2-[(3-溴-6-喹啉基)氧基]-N-(1,1-甲基乙基)丁醯胺。

「非組分(a)與組分(b1)至(b45)；(b46)殺真菌劑之殺真菌劑」亦包括(b46.6) N'-[4-[[3-[(4-氯苯基)甲基]-1,2,4-噁二唑-5-基]氧基]-2,5-二甲苯基]-N-乙基-N-雙甲脒，其咸信為可抑制涉及固醇生合成之 C24-甲基轉移酶。

在本發明之實施例中，包括下述者，除非另有指明，否則提及式 1 時包括其 N-氧化物及其鹽類，且除非在實施例中有進一步界定，否則提及「一式 1 化合物」時包括在發明內容中所界定的取代基定義。

實施例 1. 包含發明內容中所述之組分(a)與(b)的組成物，其中在式 1 中，X 為 CHOH 或 NH。

實施例 2. 實施例 1 之組成物，其中 X 為 CHOH。

實施例 3. 實施例 1 之組成物，其中 X 為 NH。

實施例 4. 包含發明內容中所述之組分(a)與(b)的組成物或實施例 1 至 3 其中任一者，其中在式 1 中，R¹ 為鹵素。

實施例 5. 實施例 4 之組成物，其中 R¹ 為 F、Cl 或 Br。

實施例 6. 實施例 5 之組成物，其中 R^1 為 Cl 或 Br。

實施例 7. 包含發明內容中所述之組分(a)與(b)的組成物或實施例 1 至 6 其中任一者，其中在式 1 中， R^2 為 H、氰基、F、Cl、Br 或 C_1-C_2 烷氧基。

實施例 8. 實施例 7 之組成物，其中 R^2 為 H、氰基、F、Cl、Br 或甲氧基。

實施例 9. 實施例 8 之組成物，其中 R^2 為氰基、F、Cl 或甲氧基。

實施例 10. 實施例 9 之組成物，其中 R^2 為 F 或 Cl。

實施例 11. 實施例 8 之組成物，其中 R^2 為 H。

實施例 12. 包含發明內容中所述之組分(a)與(b)的組成物或實施例 1 至 11 其中任一者，其中在式 1 中， R^3 為 H 或鹵素。

實施例 13. 實施例 12 之組成物，其中 R^3 為 H、F、Cl 或 Br。

實施例 14. 實施例 13 之組成物，其中 R^3 為 H、F 或 Cl。

實施例 15. 實施例 14 之組成物，其中 R^3 為 H 或 F。

實施例 16. 包含發明內容中所述之組分(a)與(b)的組成物或實施例 1 至 11 其中任一者，其中在式 1 中， R^3 為鹵素或甲基。

實施例 17. 實施例 16 之組成物，其中 R^3 為鹵素。

實施例 18. 實施例 17 之組成物，其中 R^3 為 F、Cl 或 Br。

實施例 19. 實施例 14 或 18 之組成物，其中 R^3 為 F 或 Cl。

實施例 20. 實施例 15 或 19 之組成物，其中 R^3 為 F。

實施例 21. 包含發明內容中所述之組分(a)與(b)的組成物或實施例 1 至 20 其中任一者，其中在式 1 中， R^4 為 F、Cl 或 Br。

實施例 22. 實施例 21 之組成物，其中 R^4 為 Cl 或 Br。

實施例 23. 包含發明內容中所述之組分(a)與(b)的組成物或實施例 1 至 22 其中任一者，其中在式 1 中， R^5 為 H、氰基、F、Cl、Br 或 C_1-C_2 烷氧基。

實施例 24. 實施例 23 之組成物，其中 R^5 為 H、氰基、F、Cl 或甲氧基。

實施例 25. 實施例 24 之組成物，其中 R^5 為氰基、F、Cl 或甲氧基。

實施例 26. 實施例 25 之組成物，其中 R^5 為氰基或 F。

實施例 27. 實施例 26 之組成物，其中 R^5 為氰基。

實施例 28. 實施例 26 之組成物，其中 R^5 為 F。

實施例 29. 包含發明內容中所述之組分(a)與(b)的組成物或實施例 1 至 28 其中任一者，其中在式 1 中， R^6 為 H、F、Cl 或 Br。

實施例 30. 實施例 29 之組成物，其中 R^6 為 H 或 F。

實施例 31. 實施例 30 之組成物，其中 R^6 為 H。

實施例 32. 包含發明內容中所述之組分(a)與(b)的組成物或實施例 1 至 31 其中任一者，其中在式 1 中， R^2 與 R^3 最多只有其中一者為 H(亦即 R^2

與 R^3 只有其中一個為 H，或者 R^2 與 R^3 皆非為 H)。

實施例 33. 實施例 32 之組成物，其中 R^3 為 H(並且 R^2 非為 H)。

實施例 34. 實施例 32 之組成物，其中 R^2 為 H(並且 R^3 非為 H)。

實施例 35. 實施例 32 之組成物，其中 R^2 與 R^3 皆非為 H。

實施例 36. 包含發明內容中所述之組分(a)與(b)的組成物或實施例 1 至 35 其中任一者，其中在式 1 中， R^5 與 R^6 最多只有其中一者為 H(亦即 R^5 與 R^6 只有其中一者為 H，或者 R^5 與 R^6 皆非為 H)。

實施例 37. 實施例 36 之組成物，其中 R^6 為 H(並且 R^5 非為 H)。

實施例 38. 實施例 36 之組成物，其中 R^5 為 H(並且 R^6 非為 H)。

實施例 39. 實施例 36 之組成物，其中 R^5 與 R^6 皆非為 H。

實施例 40. 包含發明內容中所述之組分(a)與(b)的組成物或實施例 1 至 39 其中任一者，其中在式 1 中， R^2 、 R^3 、 R^4 與 R^6 最多只有其中兩者為 H。

實施例 41. 實施例 40 之組成物，其中 R^2 、 R^3 、 R^4 與 R^6 其中兩者為 H。

實施例 42. 實施例 40 之組成物，其中 R^2 、 R^3 、 R^4 與 R^6 最多只有其中一者為 H。

實施例 43. 實施例 42 之組成物，其中 R^2 、 R^3 、 R^4 與 R^6 其中一者為 H。

實施例 44. 包含發明內容中所述之組分(a)與(b)的組成物或實施例 1 至 43 其中任一者，其中組分(a)未包含一式 1 化合物之一 *N*-氧化物。

實施例 45. 包含發明內容中所述之組分(a)與(b)的組成物或實施例 1 至 44 其中任一者，其中組分(a)包含一選自由以下所組成之群組的化合物：

N,4-雙(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 47)、

N-(2-溴-4,6-二氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 143)、

N-(2-溴-4,6-二氟苯基)-4-(2-溴-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 195)、

N-(2-溴-4,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 144)、

N-(4-氯-2,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 81)、

4-[5-[(4-氯-2-氟苯基)胺基]-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-基]-3,5-二氟苯甲腈(化合物 40)、

N-(2-氯-4,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 82)、

4-[5-[(2-氯-4,6-二氟苯基)胺基]-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-基]-3-氟苯甲腈(化合物 238)、

4-[[4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基]氧基]-3,5-二氟苯甲腈(化合物 13)、

4-(2-氯-4-氟苯基)-*N*-(2,4-二氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 136)、

4-(2-氯-4-氟苯基)-*N*-(2,6-二氯-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 3)、

4-(2-氯-4-氟苯基)- α -(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-甲醇(化合物 122)、

N-(2,4-二氯-6-氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 161)、

4-(2,4-二氯苯基)-*N*-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 17)、

4-(2,6-二氯-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-*N*-(2,4,6-三氟苯基)-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 7)、

4-[[1,3-二甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)-1*H*-吡唑-5-基]氧基]-3,5-二氟苯甲腈(化合物 8)、

4-(2-氯-4-氟苯基)-*N*-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 239)、

4-(2-溴-4-氟苯基)-*N*-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 240)、

N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 241)、

4-(2-溴-4-氟苯基)-*N*-(2-溴-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 244)、

N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 245)、

N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 247)、

4-(2-氯-4-氟苯基)-*N*-(2-氟-6-甲基苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 252)、

4-(2-氯-4-氟苯基)-*N*-(2-氯-6-甲基苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 253)、

N-(2-溴-6-甲基苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 254)、

N-(2-氯-6-甲基苯基)-4-(2-氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 257)、

N-(2-溴-6-甲基苯基)-4-(2-氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 258)、

4-(2-氟-4-甲氧苯基)-*N*-(2-氟-6-甲基苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 259)、

N-(2-氯-6-氟苯基)-4-(2-氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 260)、

N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 261)、

4-(2-氯-4-甲氧苯基)-*N*-(2-氯-6-甲基苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 262)、

N-(2-溴-6-甲基苯基)-4-(2-氯-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 263)、

N-(2-溴-6-甲基苯基)-4-(2-氯-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 264)、

N-(2-溴-6-甲苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 265)、
4-(2-溴-4-氟苯基)-*N*-(2-溴-6-甲苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 266)、
4-(2-溴-4-氟苯基)-*N*-(2-氟-6-甲苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 267)、
4-(2,4-二氟苯基)-*N*-(2-氟-6-甲苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 268)、
N-(2-氯-6-甲苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 269)、
4-(2,4-二氟苯基)-*N*-(2,6-二甲苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 270)、
4-(2-氯-4-氟苯基)-*N*-(2,6-二甲苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 271)、
N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 273)、
N-(2-氯-6-氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 275)以及
4-(2-溴-4-氟苯基)-*N*-(2-氯-6-甲苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 276)。
(達成之程度為該群組之化合物落於其母實施例之範疇中)。

實施例 46. 實施例 45 之組成物，其中組分(a)包含一選自由化合物 3、7、8、13、17、40、47、81、82、122、136、143、144、161、195、238、239、240 與 241 所組成之群組的化合物。

實施例 47. 實施例 46 之組成物，其中組分(a)包含一選自由化合物 3、7、8、13、17、40、47、81、82、122、136、143、144、161、195 與 238 所組成之群組的化合物。

實施例 48. 實施例 45 之組成物，其中組分(a)包含一選自由化合物 239、240、241、244、245、247、252、253、254、257、258、259、260、261、262、263、264、265、266、267、268、269、270、271、273、275 與 276 所組成之群組的化合物。

實施例 49. 實施例 48 之組成物，其中組分(a)包含一選自由化合物 239、240 與 241 所組成之群組的化合物。

實施例 50. 實施例 45 之組成物，其中組分(a)包含一選自由化合物 195 與化合物 238 所組成之群組的化合物。

實施例 51. 包含發明內容中所述之組分(a)與(b)的組成物或實施例 1 至 50 其中任一者，其限制條件為當組分(a)由一選自由以下所組成之群組的化合物所組成：

4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-N-(2,4,6-三氟苯基)-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 4)、

4-(2,6-二氟-4-甲氧苯基)-N-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 6)、

4-(2,6-二氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-N-(2,4,6-三氟苯基)-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 7)、

4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-*N*-(2,4,6-三氟苯基)-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 11)、

4-[[4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基]氧基]-3,5-二氟苯甲腈(化合物 13)、

4-[[4-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基]氧基]-3-氟苯甲腈(化合物 130)、

4-(2-氯-4-氟苯基)-*N*-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 46)、

4-[[4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基]氧基]-3-氟苯甲腈(化合物 33)、

3-氯-4-[[4-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基]氧基]苯甲腈(化合物 127)、

4-(2-氯-4-氟苯基)- α -(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-甲醇(化合物 122)、

N,4-雙(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 47)、

N-(2-氯-4-氟苯基)-4-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 58)、

N-(2-氯-4,6-二氟苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 86)、

N-(2-氯-4,6-二氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 117)、

N-(4-氯-2,6-二氟苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 121)、

N-(4-氯-2,6-二氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 126)、

3-氯-4-[[4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基]氧基]苯甲腈(化合物 37)、

4-[[4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基]胺基]-3,5-二氟苯甲腈(化合物 25)、

N-(2-氯-4-氟苯基)-4-(2,6-二氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 23)、

α ,4-雙(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-甲醇(化合物 123)、

N-(4-氯-2,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 81)、

N-(2-氯-4,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 82)、

N-(2,6-二氯-4-氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 137)、

3-氯-4-[5-[(2-氯-4,6-二氟苯基)胺基]-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-基]苯甲腈(化合物 108)、

3-氯-4-[5-[(4-氯-2,6-二氟苯基)胺基]-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-基]苯甲腈(化合物 111)、

N-(2-溴-4-氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 118)、

4-(2-氯-4-氟苯基)-*N*-(2,4-二氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 136)、

4-(2-氯-4-氟苯基)-*N*-(2,6-二氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 138)、

4-[[4-(2-溴-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基]氧基]-3-氟苯甲腈(化合物 79)、

N-(2-溴-4-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 73)、
4-(2-溴-4-氟苯基)-1,3-二甲基-*N*-(2,4,6-三氟苯基)-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 74)、
N-(4-溴-2,6-二氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 133)、
4-[[4-(2-溴-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基]氧基]-3,5-二氟苯甲腈(化合物 65)、
4-(2-溴-4-氟苯基)-*N*-(2-氯-4,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 84)、
4-(2-溴-4-氟苯基)-*N*-(4-氯-2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 129)、
N-(4-溴-2,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 134)、
3-溴-4-[[4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基]氧基]苯甲腈(化合物 139)、
3-氯-4-[[4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基]氧基]苯甲腈(化合物 140)、
N-(2,4-二氯-6-氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 141)、
N-(2,6-二氯-4-氟苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 142)、
N-(2-溴-4,6-二氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 143)、
N-(2-溴-4,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 144)、

N-(4-溴-2,6-二氟苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 145)、

N-(2-溴-4,6-二氟苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 146)、

N-(2-溴-4,6-二氟苯基)-4-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 147)、

α -(4-氯-2,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-甲醇(化合物 148)、

4-[5-[(2-氯-4,6-二氟苯基)胺基]-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-基]-3-氟苯甲腈(化合物 238)、

4-[5-[(4-氯-2,6-二氟苯基)胺基]-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-基]-3-氟苯甲腈(化合物 150)、

α -(2-氯-4,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-甲醇(化合物 151)、

α -(2-溴-4-氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-甲醇(化合物 152)及

α -(2-溴-4-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-甲醇(化合物 153)、

則組分(b)包含至少兩種殺真菌化合物，並且

- (1) 當組分(b)係由兩種殺真菌化合物之二成分組合物所組成，其中一種殺真菌化合物為環克座、待克利、依普座、滅特座、邁克尼、丙硫菌唑或得克利，則另一種殺真菌化合物非為亞托敏、必殺芬、白克列、賽芬胺、氟吡菌醯胺、異吡聯(isopyrazam)、克收欣、滅芬農、

吡嗪菌胺、啉氧菌酯、丙氧喹啉、百克敏、快諾芬、環丙吡菌胺或三氟敏，以及

- (2) 當組分(b)係由三種殺真菌化合物之三成分組合物所組成，其中一種殺真菌化合物為環克座、待克利、依普座、滅特座、邁克尼、丙硫菌唑或得克利，並且另一種殺真菌化合物為啉氧菌酯或三氟敏，則第三種殺真菌化合物非為丙氧喹啉。

以上本發明實施例(包括實施例 1-51)以及任何其他本文中所述之實施例可以任何方式組合，並且實施例中之變數描述不只適用於包含式 1 化合物且具有至少一種其他殺真菌化合物之組成物，亦適用於包含式 1 化合物且具有至少一種其他無脊椎害蟲防治化合物或藥劑之組成物，並且亦適用於可用於製備該式 1 化合物之起始化合物與中間化合物。此外，以上本發明實施例(包括實施例 1-51)與任何其他本文中所述之實施例以及其任何組合物係適用於本發明之方法。因此值得注意的進一步實施例為以上所揭露的組成物，其包含(a)至少一種選自上述式 1 化合物、其 *N*-氧化物及其鹽之化合物；以及至少一種無脊椎害蟲防治化合物或藥劑，其限制條件是當組分(a)係由一選自由實施例 51 所列示者所組成之群組的化合物所組成，則該組成物包含至少兩種無脊椎害蟲防治化合物或藥劑，或至少一種額外殺真菌化合物(亦即除了式 1 化合物以外之殺真菌化合物)。

實施例 1-51 之組合說明如下：

實施例 A1. 包含發明內容中所述之組分(a)與(b)的組成物，其中組分(a)包含一式 1 化合物或其鹽，其中在式 1 中，

R^2 與 R^3 最多只有其中一者為 H；並且

R^5 與 R^6 最多只有其中一者為 H。

實施例 A2. 實施例 A1 的組成物，其中在式 1 中，

R^1 為 F、Cl 或 Br；

R^2 為 H、氰基、F、Cl、Br 或甲氧基；

R^3 為 H、F 或 Cl；

R^4 為 F、Cl 或 Br；

R^5 為 H、氰基、F、Cl 或甲氧基；以及

R^6 為 H 或 F。

實施例 A3. 實施例 A2 的組成物，其中在式 1 中，

R^3 為 H 或 F；以及

R^5 為氰基、F、Cl 或甲氧基。

實施例 A4. 實施例 A3 之組成物，其中組分(a)包含一

選自由以下所組成之群組的化合物：化合物 3、化合物 7、化合物 8、化合物 13、化合物 17、化合物 40、化合物 47、化合物 81、化合物 82、化合物 122、化合物 136、化合物 143、化合物 144、化合物 161、化合物 195、化合物 238、化合物 239、化合物 240 與化合物 241。

實施例 A5. 實施例 A4 之組成物，其中組分(a)包含一

選自由以下所組成之群組的化合物：化合物 3、化合物 7、化合物 8、化合物 13、化合物

17、化合物 40、化合物 47、化合物 81、化合物 82、化合物 122、化合物 136、化合物 143、化合物 144、化合物 161、化合物 195 與化合物 238。

實施例 A6. 包含發明內容中所述之組分(a)與(b)的組成物，其中組分(a)包含一式 1 化合物或其鹽，其中在式 1 中，

X 為 NH；

R¹ 為鹵素或甲基；

R² 為 H；

R³ 為鹵素或甲基；

R⁴ 為鹵素；

R⁵ 為 H、氰基、鹵素或 C₁-C₂ 烷氧基；以及

R⁶ 為 H 或鹵素；

其限制條件是當 R¹ 為 F，則 R³ 為 Cl，而當 R¹ 為 Cl，則 R³ 為 F。

實施例 A7. 實施例 A6 的組成物，其中在式 1 中，

R³ 為 F 或 Cl。

實施例 A8. 實施例 A7 的組成物，其中在式 1 中，

R¹ 為 Cl 或 Br；以及

R³ 為 F。

實施例 A9. 實施例 A6 至 A8 其中任一者的組成物，其中在式 1 中，R⁵ 與 R⁶ 最多只有其中一者為 H。

實施例 A10. 實施例 A9 的組成物，其中在式 1 中，

R^4 為 F、Cl 或 Br；

R^5 為 H、氰基、F、Cl 或甲氧基；以及

R^6 為 H 或 F。

實施例 A11. 實施例 A10 的組成物，其中在式 1 中，

R^5 為氰基、F、Cl 或甲氧基。

實施例 A12. 實施例 A6 之組成物，其中組分(a)包含一選自由以下所組成之群組的化合物：化合物 239、化合物 240 與化合物 241。

實施例 B1. 發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b1)苯并咪唑胺基甲酸甲酯類殺真菌劑的化合物，例如免賴得、貝芬替與甲基多保淨。

實施例 B2. 發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b2)二羧醯亞胺類殺真菌劑的化合物，例如撲滅寧、依普同與免克寧。

實施例 B3. 發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b3)去甲基作用抑制劑類殺真菌劑的化合物，例如依普座、氟喹唑、三泰隆、矽氟唑、種菌唑、賽福寧、環克座、待克利、護矽得、護汰芬、滅特座、邁克尼、撲克拉、普克利、丙硫菌唑、得克利與四克利。

實施例 B4.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b4)苯基醯胺類殺真菌劑的化合物，例如滅達樂、滅達樂-M、本達樂、右本達樂、呋霜靈、呋醯胺與毆殺斯。

實施例 B5.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b5)胺/嗎啉類殺真菌劑的化合物，例如愛地福、十二環嗎啉、芬普福、三得芬、三芬醯胺三賽唑、苯鏽啖、粉病靈(piperalin)與萁孢菌素。

實施例 B6.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b6)磷脂質生合成抑制劑類殺真菌劑的化合物，例如護粒松與亞賜圃。

實施例 B7.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b7)羧醯胺類殺真菌劑的化合物，例如必殺芬、白克列、萎鏽靈、異吡聯(isopyrazam)、嘉保信、派福芬與吡噻菌胺。

實施例 B8.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b8)

經基(2-胺基-)嘧啶類殺真菌劑的化合物，例如依瑞莫。

實施例 B9.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b9)苯胺嘧啶類殺真菌劑的化合物，例如賽普洛。

實施例 B10.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b10)N-苯基胺基甲酸酯類殺真菌劑的化合物，例如乙霉威。

實施例 B11.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b11)醌外抑制劑類殺真菌劑的化合物，例如亞托敏、百克敏、唑胺菌酯、克收欣、三氟敏、啉氧菌酯、唑菌酯、防霉丹、凡殺同、咪唑菌酮、敵可挫、因司唑賓(enestrobin)、醚菌胺、苯氧菌胺、肟醚菌胺與氟嘧菌酯。

實施例 B12.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b12)苯基吡咯類殺真菌劑的化合物，例如拌種咯或護汰寧。

實施例 B13.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的

組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b13) 喹啉類殺真菌劑的化合物，例如快諾芬。

實施例 B14.發明內容中所述的組成物(包括但不限於 實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的 組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b14) 脂質過氧化抑制劑類殺真菌劑的化合物，例如 二氯甲氧苯。

實施例 B15.發明內容中所述的組成物(包括但不限於 實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的 組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b15) 黑色素生合成抑制劑-還原酶類殺真菌劑的化 合物，例如百快隆與三賽唑。

實施例 B16.發明內容中所述的組成物(包括但不限於 實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的 組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b16) 黑色素生合成抑制劑-脫水酶類殺真菌劑的化 合物，例如加普胺。

實施例 B17.發明內容中所述的組成物(包括但不限於 實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的 組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b17) 羥基苯胺類殺真菌劑的化合物，例如環醯菌 胺。

實施例 B18.發明內容中所述的組成物(包括但不限於 實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的 組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b18)

鯊烯-環氧酶抑制劑類殺真菌劑的化合物，例如稗草畏(pyributicarb)。

實施例 B19.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b19)多氧菌素類殺真菌劑的化合物，例如多氧菌素。

實施例 B20.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b20)苯脲類殺真菌劑的化合物，例如賓克隆。

實施例 B21.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b21)醌內抑制劑類殺真菌劑的化合物，例如賽座滅與安美速。

實施例 B22.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b22)苯甲醯胺類殺真菌劑的化合物，例如座賽胺。

實施例 B23.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b23)哌喃糖醛酸類抗生素殺真菌劑的化合物，例如保米黴素。

實施例 B24.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b24)六碳糖哌喃糖苷基抗生素類殺真菌劑的化合物，例如嘉賜黴素。

實施例 B25.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b25)葡萄哌喃糖苷基抗生素的化合物：蛋白質合成類殺真菌劑，例如鏈黴素。

實施例 B26.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b26)葡萄哌喃糖苷基抗生素的化合物：繭蜜糖酶以及肌醇生合成類殺真菌劑，例如維利黴素。

實施例 B27.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b27)氰基乙醯胺肟類(cyanoacetylamiideoxime)殺真菌劑的化合物，例如克絕。

實施例 B28.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b28)胺基甲酸酯類殺真菌劑的化合物，例如普拔克、胺丙威以及愛得寶。

實施例 B29.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b29)氧化磷酸化解偶合類殺真菌劑的化合物，例如扶吉胺、百蟊克、富米綜、氧乙酸基白粉克以及白粉克。

實施例 B30.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b30)有機錫類殺真菌劑的化合物，例如三苯醋錫。

實施例 B31.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b31)羧酸類殺真菌劑的化合物，例如歐索林酸。

實施例 B32.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b32)雜芳族類殺真菌劑的化合物，例如殺紋寧。

實施例 B33.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b33)膦酸鹽類殺真菌劑的化合物，例如亞磷酸以及其各式不同鹽類，包括福賽得(fosetyl-aluminum)。

實施例 B34.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的

組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b34)鄰胺甲醯苯甲酸類殺真菌劑的化合物，例如克枯爛。

實施例 B35.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b35)苯并三吡啶類殺真菌劑的化合物，例如咪唑嗪。

實施例 B36.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b36)苯磺醯胺類殺真菌劑的化合物，例如氟硫滅。

實施例 B37.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b37)噻吡酮類殺真菌劑的化合物，例如達滅淨。

實施例 B38.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b38)噻吩-羧醯胺類殺真菌劑的化合物，例如矽噻菌胺。

實施例 B39.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b39)嘧啶醯胺類殺真菌劑的化合物，例如二氟林。

實施例 B40.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的

組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b40)羧酸醯胺類殺真菌劑的化合物，例如達滅芬、苯噻菌胺、苯噻菌胺-異丙基、丙森鋅、瓦芬耐、曼普胺與氟嗎啉。

實施例 B41.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b41)四環素抗生素類殺真菌劑的化合物，例如氧四環素。

實施例 B42.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b42)硫胺甲酸酯類殺真菌劑的化合物，例如減速克。

實施例 B43.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b43)苯甲醯胺類殺真菌劑的化合物，例如氟比來與氟吡菌醯胺。

實施例 B44.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b44)誘發寄主植物防禦類殺真菌劑，例如阿拉酸式苯-S-甲基。

實施例 B45.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的

組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b45)多重位點接觸類殺真菌劑的化合物，例如氯氧化銅、硫酸銅、氫氧化銅、波多組成物(三元硫化銅)、元素硫、鋅錳乃浦、免得爛、甲基鋅乃浦、富爾邦、錳乃浦、得恩地、鋅乃浦、福美鋅、福爾培、蓋普丹、四氯丹與四氯異苯腈。

實施例 B46.發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自(b46)殺真菌劑且非為組分(a)與組分(b1)至(b45)殺真菌劑之化合物，例如噻唑菌胺、賽芬胺、丙氧喹啉、滅芬農、派芬農、辛唑嘧菌胺、比托沙、新阿蘇仁、胺苯吡菌酮、吡咯菌素、滅蟎蟊、泰伏勤、5-氯-6-(2,4,6-三氟苯基)-7-(4-甲哌啶-1-基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶(BAS600)、2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4*H*-1-苯并哌喃-4-酮、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基-3-異噁唑烷基異噁唑啉基]吡啶(SYP-Z048)、*N*-[1-[[[1-(4-氯苯基)乙基]磺醯基]甲基]丙基]胺基甲酸 4-氯苯酯(XR-539)、*N*-[[[環丙甲氧基]胺基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]亞甲基]苯乙醯胺、*N'*-[4-[4-氯-3-(三氟甲基)苯氧基]-2,5-二甲苯基]-*N*-乙基-*N*-甲基甲醯亞胺醯胺、2-[[2-氯-5-(三氟甲基)苯基]硫基]-2-[3-(2-甲氧基)-2-亞四氫噻唑基]乙腈(OK-5203)、

N-(4-氯-2-硝苯基)-*N*-乙基-4-甲苄磺醯胺 (TF-991) 與 1-[(2-丙烯硫基)羰基]-2-(1-甲基乙基)-4-(2-甲苯基)-5-胺-1*H*-吡唑-3-酮。

實施例 B47. 發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自由以下所組成之群組的殺真菌化合物(殺真菌劑)：亞托敏、克收欣、三氟敏、百克敏、唑菌酯、唑胺菌酯、啞氧菌酯、醚菌胺、苯氧菌胺、貝芬替、四氯異苯腈、快諾芬、滅芬農、派芬農、賽芬胺、苯鏽啞、芬普福、溴克座、環克座、待克利、依普座、芬克座、護矽得、菲克利、種菌唑、滅特座、邁克尼、平克座、普克利、丙氧喹啉、丙硫菌唑、得克利、滅菌唑、凡殺同、撲克拉、吡噻菌胺與白克利(nicobifen)。

實施例 B48. 實施例 B47 的組成物，其中組分(b)包括至少一種選自由以下所組成之群組的化合物：亞托敏、克收欣、三氟敏、百克敏、唑胺菌酯、唑菌酯、啞氧菌酯、醚菌胺、苯氧菌胺、快諾芬、滅芬農、派芬農、賽芬胺、苯鏽啞、芬普福、環克座、待克利、依普座、護矽得、滅特座、邁克尼、普克利、丙氧喹啉、丙硫菌唑、得克利、滅菌唑、凡殺同與吡噻菌胺。

實施例 B49. 發明內容中所述的組成物(包括但不限於實施例 1 至 51 以及 A1 至 A12 其中任一種的

組成物)，其中組分(b)包括至少一種選自由式 A1 化合物及其鹽的殺真菌化合物，其中式 A1 及其上之取代基係如本文中所揭露之(b46.5)類 6-喹啉氧乙醯胺化合物。

實施例 B50.實施例 B49 的組成物，其中組分(b)包括至少一種選自由以下所組成之群組的殺真菌化合物：2-[(3-溴-6-喹啉基)氧基]-N-(1,1-二甲基-2-丁炔-1-基)-2-(甲硫基)乙醯胺、N-(1,1-二甲基-2-丁炔-1-基)-2-[(3-乙炔基-6-喹啉基)氧基]-2-(甲硫基)乙醯胺、2-[(3-溴-8-甲基-6-喹啉基)氧基]-N-(1,1-二甲基-2-丙炔-1-基)-2-(甲硫基)乙醯胺與 2-[(3-溴-6-喹啉基)氧基]-N-(1,1-二甲基乙基)丁醯胺。

值得注意的是本文中所述之實施例其中任一者的組成物，其包括實施例 1 至 51、A1 至 A12 與 B1 至 B50，其中提及式 1 時係包括其鹽但非其 N-氧化物；因此片語「一式 1 化合物」可由片語「一式 1 化合物或其鹽」所取代。在此值得注意的組成物中，組分(a)包括一式 1 化合物或其鹽。

本發明中實施例中亦值得注意的殺真菌劑組成物包括一殺真菌有效量之實施例 1 至 51、A1 至 A12 以及 B1 至 B50 的組成物以及至少一種額外之組分，該組分係選自由表面活性劑、固體稀釋劑與液體稀釋劑所組成之群組。

本發明之實施例進一步包括用於控制由真菌類植物病原體造成之病害的方法，該方法包含施予該植物或

其部分或植物種子或幼苗一殺真菌有效量之實施例 1 至 51、A1 至 A12 以及 B1 至 B50 其中任一種的組成物(例如作為一包括本文中所述之製劑成分的組成物)。本發明之實施例亦包括用於保護一植物或植物種子免於感染由真菌類病原體造成之病害的方法，該方法包含施予一殺真菌有效量之實施例 1 至 51、A1 至 A12 以及 B1 至 B50 其中任一種的組成物至該植物或植物種子。

本發明的某些實施例涉及防治一植物病害或保護植物免於感染主要摧殘植物葉子的植物病害，與/或施予本發明組成物至植物葉子(即植物而非種子)。較佳之使用方法包含涉及上述之較佳組成物者；以及能以特定有效性防治的病害，包括由真菌類植物病原體造成的植物病害。依據本發明使用的殺真菌劑組合可利於疾病防治以及阻礙抗性發展。

方法實施例進一步包含：

實施例 C1.一種用於保護植物免於感染選自以下疾病的方法：白粉病、葉鏽病與葉枯病(*Septoria disease*)，其包含施予該植物一殺真菌有效量之組成物，該組成物包含發明內容或實施例 1 至 51 其中任一者中所述的組分(a)與(b)。

實施例 C2.實施例 C1 的方法，其中該病害為白粉病並且該組成物之組分(b)包括至少一種選自(b4)去甲基作用抑制劑(DMI)類殺真菌劑、(b11)奎寧外抑制劑(QoI)類殺真菌劑與(b46.4)丙氧喹啉的殺真菌化合物。

實施例 C3.實施例 C2 的方法，其中該病害為小麥白粉病。

實施例 C4.實施例 C2 或 C3 的方法，其中組分(b)包括至少一種選自(b4) DMI 類殺真菌劑的殺真菌化合物。

實施例 C5.實施例 C4 的方法，其中組分(b)包括至少一種選自由環克座、待克利、依普座、邁克尼、丙硫菌唑與四克利所組成之群組的殺真菌化合物。

實施例 C6.實施例 C5 的方法，其中組分(b)包括至少一種選自由環克座、待克利與丙硫菌唑所組成之群組的殺真菌化合物。

實施例 C7.實施例 C2 或 C3 的方法，其中組分(b)包括至少一種選自(b11) QoI 類殺真菌劑的殺真菌化合物。

實施例 C8.實施例 C7 的方法，其中組分(b)包括至少一種選自由亞托敏、啞氧菌酯與百克敏所組成之群組的殺真菌化合物。

實施例 C9.實施例 C2 或 C3 的方法，其中組分(b)包括(b46.4)丙氧喹啉。

實施例 C10.實施例 C1 的方法，其中該病害為葉鏽病並且該組成物之組分(b)包括芬普福。

實施例 C11.實施例 C10 的方法，其中該病害為小麥葉鏽病。

實施例 C12.實施例 C1 的方法，其中該病害為葉枯病並且該組成物之組分(b)包括至少一種選自由

依普座、滅達樂(包括滅達樂-M)、丙森鋅與芬普福所組成之群組的殺真菌化合物。

實施例 C13. 實施例 C12 的方法，其中該病害為小麥葉斑病(leaf blotch)。

實施例 C14. 一種用於保護植物免於感染葉枯病的方法，其包含施予該¹植物一殺真菌有效量之實施例 B49 或 B50 的組成物。

實施例 C15. 實施例 C14 的方法，其中該病害係由小麥穎枯病菌(*Septoria tritici*)所造成。

實施例 C16. 實施例 C14 或 C15 的方法，其中該病害為小麥葉斑病。

實施例 C17. 實施例 C1 至 C16 其中任一者之方法，其中組分(a)與(b)係以協同性有效量來施予(並且以相對於彼此為協同性的比例)。

值得注意的實施例是實施例 C1 至 C17 之對等者，其關於一種用於防治由真菌類植物病原體造成之植物病害的方法，該方法包含施予該植物或其部分一殺真菌有效量的本發明之殺真菌組成物。

如本發明內容所提及者，此發明亦涉及一上述式 1 化合物，或一其 *N*-氧化物或其鹽。亦已提及者為本發明之實施例(包括實施例 1-51)亦涉及式 1 化合物。因此，實施例 1-51 之組合物係進一步說明如下：

實施例 D1. 一式 1 化合物，或一其 *N*-氧化物或其鹽，其中

X 為 NH；

R¹ 為鹵素或甲基；

R^2 為 H；

R^3 為鹵素或甲基；

R^4 為鹵素；

R^5 為 H、氰基、鹵素或 C_1-C_2 烷氧基；以及

R^6 為 H 或鹵素；

其限制條件是當 R^1 為 F，則 R^3 為 Cl，而當 R^1 為 Cl，則 R^3 為 F。

實施例 D2. 實施例 D1 的化合物，其中

R^3 為 F 或 Cl；

實施例 D3. 實施例 D2 的化合物，其中

R^1 為 Cl 或 Br；以及

R^3 為 F。

實施例 D4. 實施例 D1 至 D4 其中任一者的化合物，

其中 R^5 與 R^6 最多只有其中一者為 H。

實施例 D5. 實施例 D4 的化合物，其中

R^4 為 F、Cl 或 Br；

R^5 為 H、氰基、F、Cl 或甲氧基；以及

R^6 為 H 或 F。

實施例 D6. 實施例 D5 的化合物，其中

R^5 為氰基、F、Cl 或甲氧基。

實施例 D7. 實施例 D1 至 D6 其中任一者的化合物，

其中該化合物非為一 *N*-氧化物的形式(即其為式 1 或一其鹽的形式)。

實施例 D8. 實施例 D1 的化合物，其係選自由以下所組成之群組：

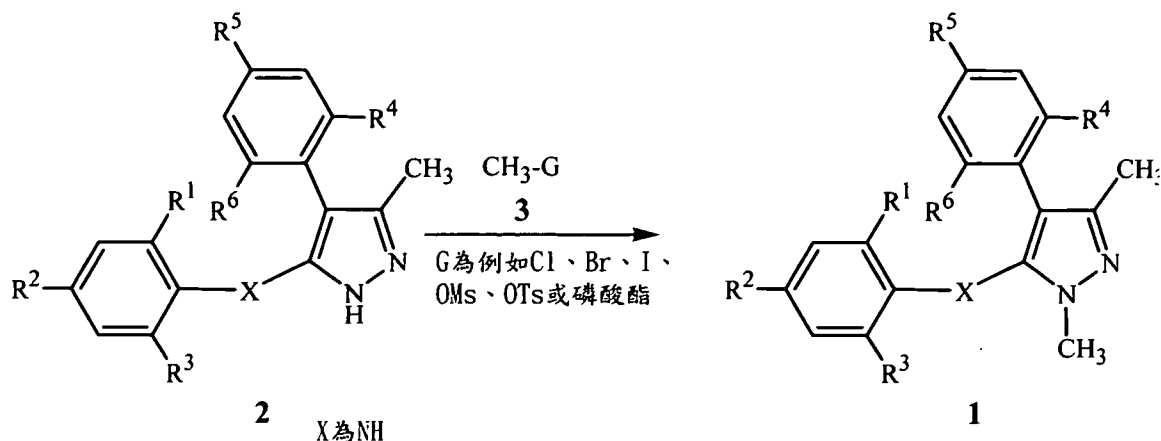
4-(2-氯-4-氟苯基)-*N*-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 239)、
4-(2-溴-4-氟苯基)-*N*-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 240)以及
N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 241)。

額外的實施例包括一殺真菌組成物，其包含：(1) 實施例 D1 至 D8 其中任一者的化合物；以及(2)至少一種選自由表面活性劑、固體稀釋劑以及液體稀釋劑所組成之群組的額外組分。額外的實施例亦包括一種用於保護植物或植物種子免於感染由真菌類病原體造成之病害的方法，該方法包含施予一殺真菌劑有效量之實施例 D1 至 D8 其中任一者的化合物至該植物(或其部分)或植物種子(直接或是透過該植物或植物種子之環境(例如生長介質))。值得注意的實施例係涉及一種用於防治由真菌類植物病原體造成之植物病害的方法者，該方法包含施予該植物或其部分一殺真菌有效量之實施例 D1 至 D8 其中任一者的化合物。

如描述於流程 1-17 中之一或多種下列方法與變化可用以製備式 1 化合物。在以下式 1-26 化合物中， R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 與 R^6 的定義係如同定義於以上發明內容中者，除非另有指明。式 1a 與 1b 係式 1 的不同子集；式 4a 與 4b 係式 4 的不同子集；式 6a 與 6b 係式 6 的不同子集；式 11a 係式 11 的一子集；而式 23a 係式 23 的一子集。用於各子集式中之取代基係定義於其母式中，除非另有指明。

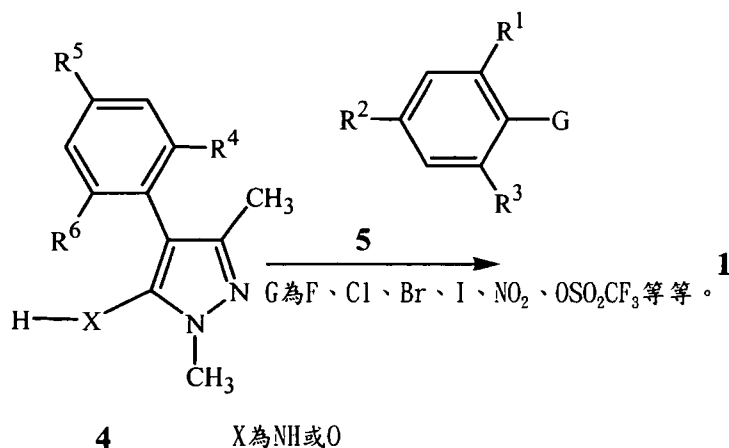
如流程 1 所示，X 為 NH 之式 1 化合物可藉由式 2 之 1*H*-吡唑化合物與各式不同之甲基化劑(例如式 3)反應而製備，例如碘甲烷、磺酸甲酯類(例如甲磺酸甲酯(OMs)或甲苯磺酸甲酯(OTs))或磷酸三甲酯，較佳為在有機鹼或無機鹼(如 1,8-二氮雙環[5.4.0]十一-7-烯、碳酸鉀或氫氧化鉀)存在下，以及在溶劑如 *N,N*-二甲基甲醯胺(DMF)、四氫呋喃(THF)、甲苯或水存在下進行反應。

流程 1



如流程 2 中所示，式 1 化合物可藉由式 4 化合物(即 X 為 NH 之 5-胺基吡唑，或 X 為 O 之 5-羥基吡唑(5-吡唑酮))與含有一脫離基 G(即鹵素或(鹵基)烷基磺酸酯)之式 5 芳族化合物反應而製備，選擇性地於一金屬催化劑存在下，並且通常於一鹼與一極性非質子溶劑如 *N,N*-二甲基甲醯胺或二甲基亞砷存在下進行反應。例如，式 5 化合物(其中苯環含有拉電子取代基者)係藉由直接由該環上置換該脫離基 G 而反應以提供式 1 化合物。流程 2 的方法係藉由合成實例 6 之步驟 D 而說明。式 5 化合物係市售可得或其製備係該項技術領域中所習知者。

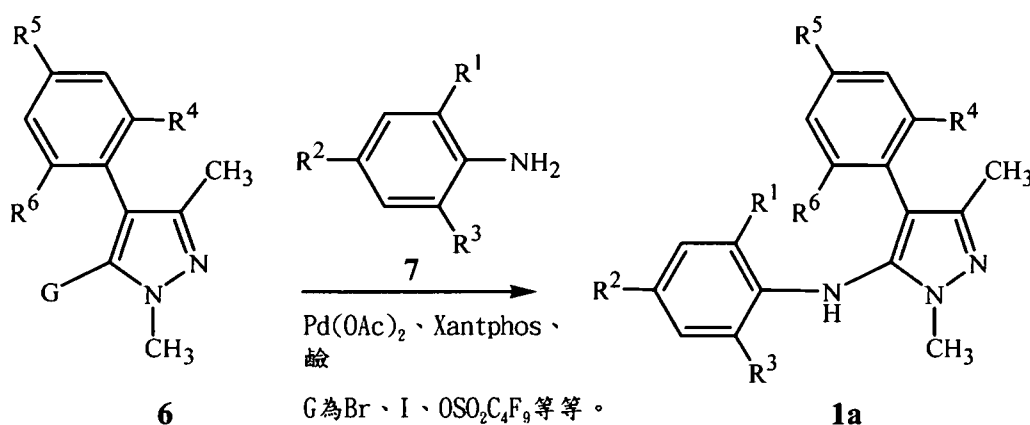
流程 2



對於依據流程 2 方法進行之式 4 化合物(其中 X 為 O 或 NH 者)與一式 5 化合物(其中芳環缺乏足夠拉電子取代基者)的反應，或者為了改善反應速率、產率或產物純度，範圍在催化量到至多超化學計量的金屬催化劑(例如金屬或金屬鹽)使用量係有利於所欲反應。典型在這些條件下，G 為 Br 或 I 或一磺酸鹽如 OS(O)₂CF₃ 或 OS(O)₂(CF₂)₃CF₃。例如，可以使用銅鹽錯合物(例如 CuI 與 *N,N'*-二甲基乙二胺、脯胺酸或聯吡啶)、鈀錯合物(例如參(二亞苳丙酮)二鈀(0))或鈀鹽(例如乙酸鈀)，其具有配位基如 4,5-雙(二苳膦)-9,9-二甲吡啶(4,5-bis(diphenylphosphino)-9,9-dimethylxanthene)(即「Xantphos」)、2-二環己膦基-2',4',6'-三異丙基聯苳(即「Xphos」)或 2,2'-雙(二苳膦)-1,1'-聯萘(即「BINAP」)，此係在例如碳酸鉀、碳酸鈹、酚鈉或三級丁氧鈉之鹼的存在下，於例如 *N,N*-二甲基甲醯胺、1,2-二甲氧乙烷、二甲亞碸、1,4-二噁烷(dioxane)或甲苳之溶劑中，其選

擇性地與醇如乙醇混合。或者如流程 3 所說明，式 1a 化合物(即式 1 中 X 為 NH 者)可藉由式 6 化合物(即 5-溴吡唑或其他在其 5-位置經一脫離基取代之吡唑)與式 7 化合物於金屬催化條件下(類似於以上流程 2 中所述者)反應而製備。流程 3 方法係藉由合成實例 1 之步驟 C 與合成實例 2 之步驟 E 而說明。式 7 化合物係市售可得或其製備係該項技術領域中所習知者。

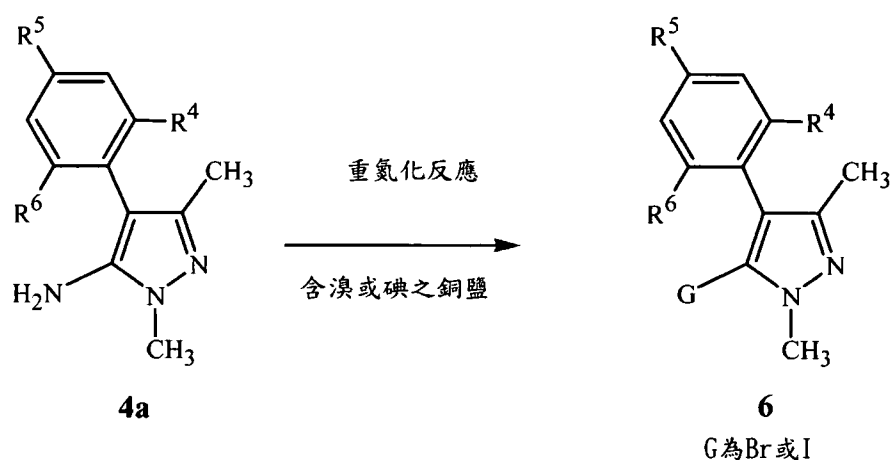
流程 3



如流程 4 中所示，其中 G 為 Br 或 I 之式 6 化合物可藉由式 4a 之 5-胺基吡唑(即其中 X 為 NH 之式 4)於重氮化條件下反應而製備，其反應可於含溴或碘之銅鹽存在下或者接著與含溴或碘之銅鹽組合而進行。例如，將亞硝酸三級丁酯於 CuBr₂(在溶劑如乙腈中)存在下加入至一式 4a 之 5-胺基吡唑的溶液，以提供對應的式 6 之 5-溴吡唑。同樣地，可將式 4a 之 5-胺基吡唑轉化為重氮鹽，而後藉由以亞硝酸鈉(在溶劑如水、乙酸或三氟乙酸)於一典型含相同鹵原子之礦物酸(例如對於 G 為 I 者係為 HI 水溶液)存在下處理以得到一對應的式 6 之 5-

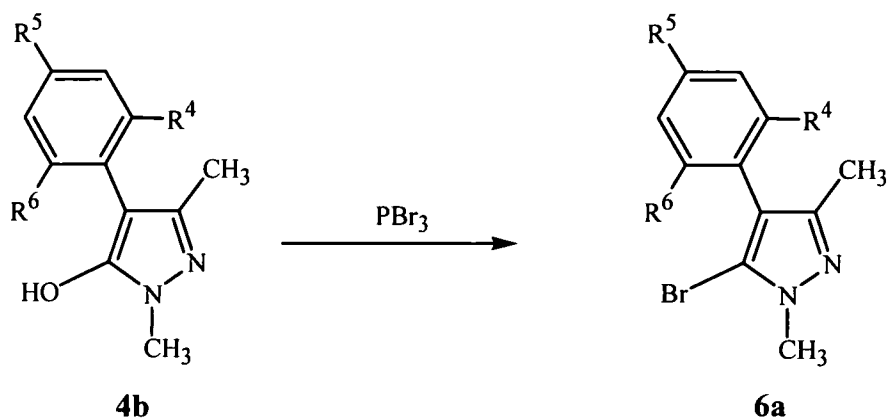
鹵吡唑，接著以對應之銅(I)或銅(II)鹽處理(依據已為熟悉該項技術領域者所熟知的通用程序)。流程 4 的方法係藉由合成實例 1 之步驟 B 與合成實例 2 之步驟 D 而說明。

流程 4



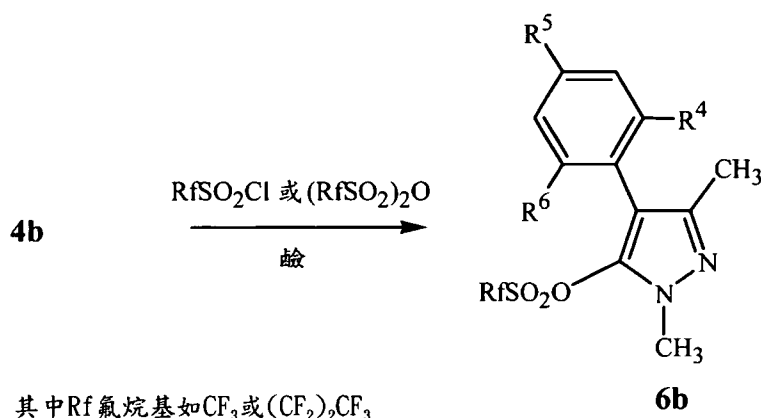
如流程 5 所示，式 6a 之 5-溴吡唑(即其中 G 為 Br 或 I 之式 6)可藉由使式 4b 之 5-羥基吡唑(即其中 X 為 O 之式 4)與三溴化磷反應而製備，如描述於 *Tetrahedron Lett.* **2000**, 41(24), 4713 中者。

流程 5



如流程 6 所示，式 4b 之 5-羥基吡唑可用於製備式 6b 之 5-氟烷磺醯基(例如 5-三氟甲磺醯基、5-九氟丁磺醯基)吡唑(即其中 G 為氟烷磺醯基之式 6)，如描述於 *Synlett* 2004, 5, 795 中者。

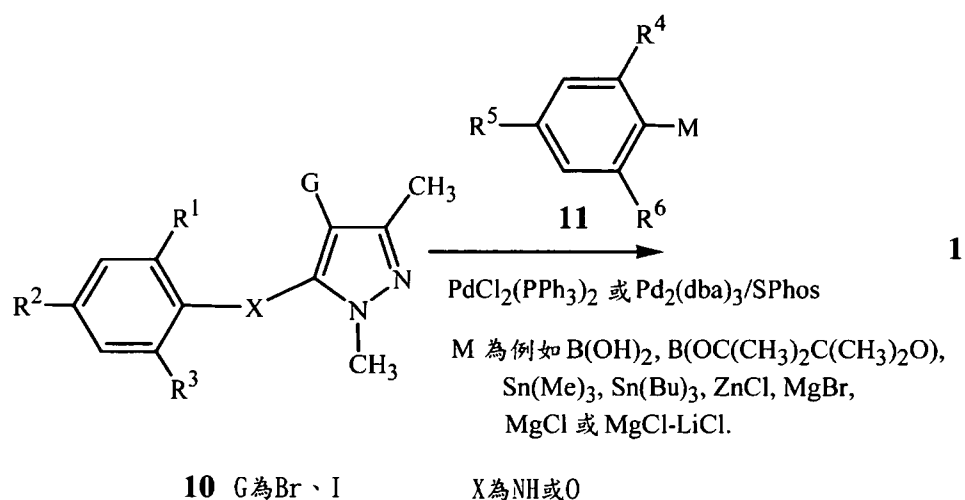
流程 6



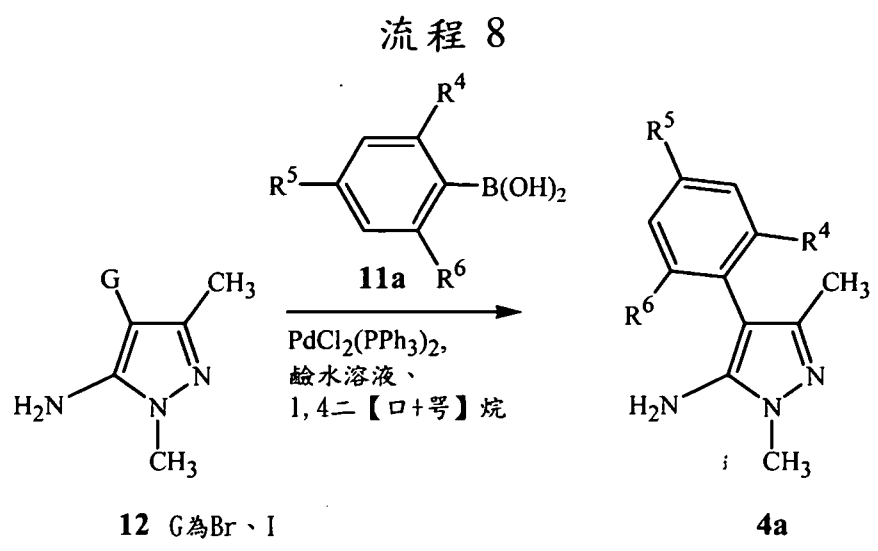
如流程 7 所示，式 1 化合物可藉由式 10 之 4-溴或碘吡唑(其中 X 為 O 或 NH 者)與式 11 有機金屬化合物於過渡金屬催化交叉偶合反應條件下反應而製備。使式 10 之 4-溴或碘吡唑與式 11 之硼酸、三烷基錫、鋅或有機鎂試劑於鈀或鎳催化劑與鹼(若有需要)存在下反應，該鈀或鎳催化劑係具有合適配位基(例如三苯基膦(PPh_3)、二亞苺丙酮(dba)、二環己基(2',6'-二甲氧基[1,1'-聯苯]-2-基)膦(SPhos))，而提供對應之式 1 化合物。例如，使一經取代之芳基硼酸或衍生物(例如其中 M 為 $\text{B}(\text{OH})_2$ 、 $\text{B}(\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{O})$ 或 $\text{B}(\text{O}-i\text{-Pr})_3^\ominus \text{Li}^\oplus$ 之式 11)與式 10 之 4-溴-或 4-碘吡唑於二氯雙(三苯基膦)鈀(II)與例如碳酸鈉或氫氧化鉀之鹼性水溶液存在下，於溶劑

如 1,4-二噁烷、1,2-二甲氧乙烷、甲苯或乙醇中，或者於具有配位基如磷氧化物或亞磷酸鹽配位基(例如二苯基磷氧化物)與在溶劑如 1,4-二噁烷中之氟化鉀的無水條件下反應(請參見 *Angewandte Chemie, International Edition* **2008**, 47(25), 4695–4698)，以提供對應之式 1 化合物。流程 7 的方法係藉由本合成實例 3 之步驟 C 而說明。

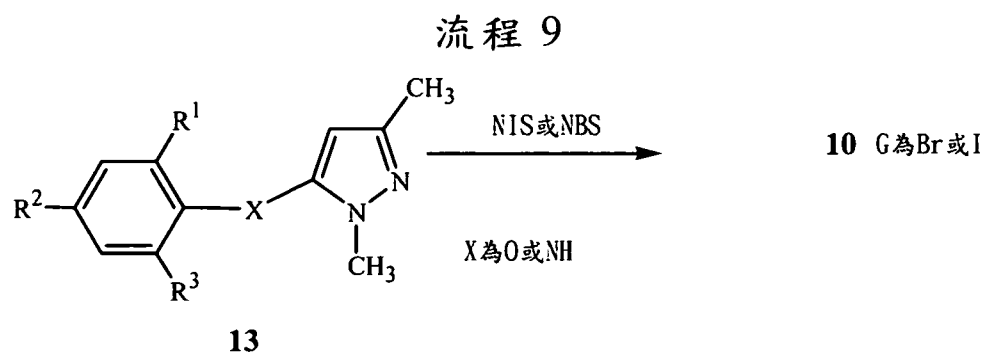
流程 7



如流程 8 所說明，式 4a 化合物(即其中 X 為 NH 之式 4)可藉由使式 12 化合物與式 11a 化合物(例如其中 M 為 B(OH)₂ 之式 11 化合物)利用過渡金屬催化交叉偶合反應條件(如流程 7 方法所述者)反應而製備。

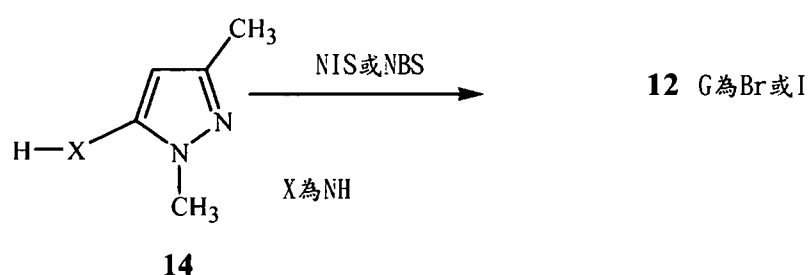


如流程 9 所說明，其中 X 為 O 或 NH 且 G 為 Br 或 I 之式 10 吡唑係藉由使未在 4-位置經取代之吡唑(式 13)與鹵化試劑如溴、亞溴酸鈉、*N*-溴琥珀醯亞胺(NBS)或 *N*-碘琥珀醯亞胺(NIS)，於溶劑如乙酸、乙腈、*N,N*-二甲基甲醯胺、*N,N*-二甲基乙醯胺或 1,4-二噁烷中，或水與前述溶劑之混合物中，在溫度範圍為環境至溶劑沸點下反應而製備。流程 9 方法係藉由合成實例 3 之步驟 B 而說明。



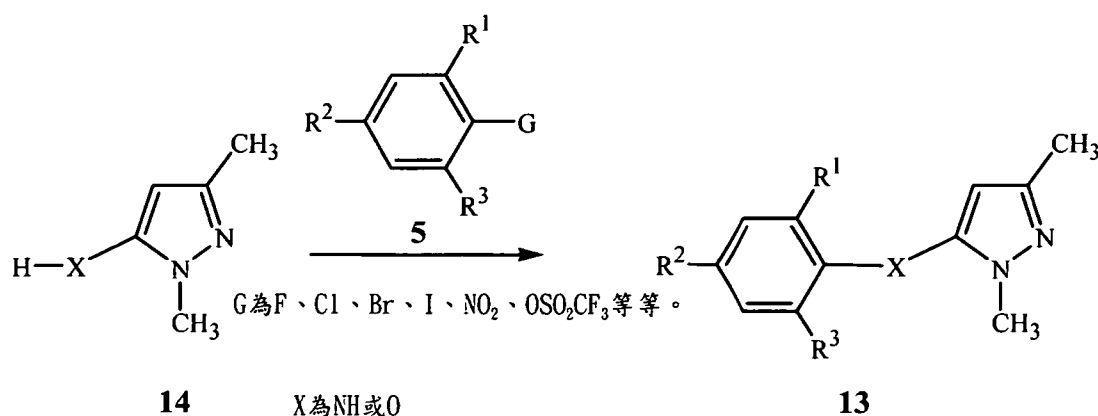
如流程 10 所說明，使用類似於流程 9 方法者之反應條件，可將其中 X 為 NH 之式 14 吡唑轉化為中間物 12，其可用於製備式 4a 化合物(如流程 8 所描繪)。其中 X 為 NH 之式 14 化合物可藉由該項技術領域中習知的方法而製備。再者，其中 X 為 NH 之式 14 化合物係市售可得。

流程 10



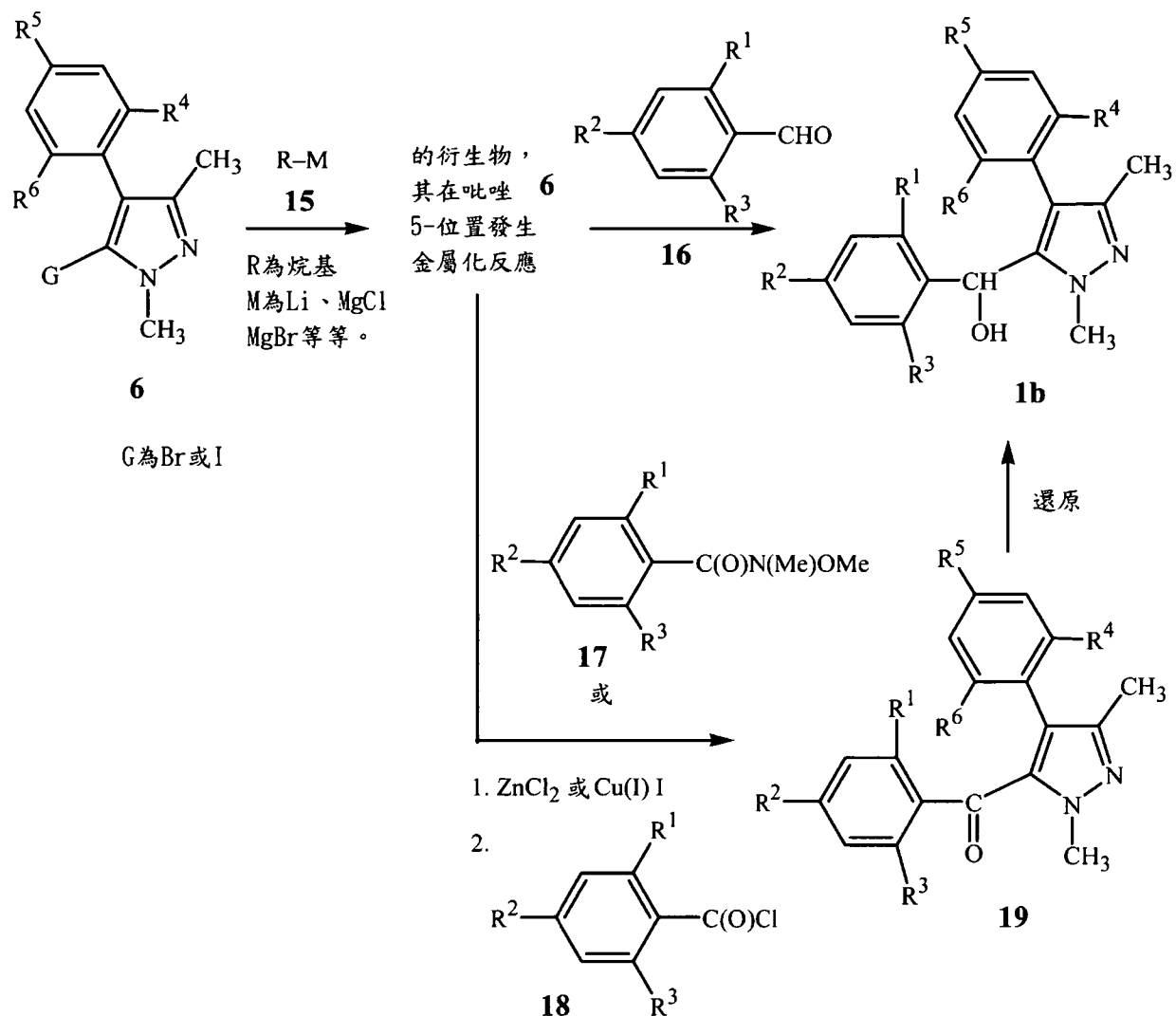
如流程 11 所示，其中 X 為 O 或 NH 之式 13 化合物可由對應之式 14 化合物藉由類似用於流程 2 方法中者的程序而製備。流程 11 方法係藉由合成實例 3 之步驟 A 而說明。式 14 化合物係市售可得或可藉由該項技術領域中所習知的方法而製備。

流程 11



如流程 12 所說明，式 1b 化合物(即其中 X 為 CHOH 之式 1)可藉由以有機金屬試劑(即式 15)或烷基鎂試劑處理式 6 化合物而製備，該有機金屬試劑例如烷基鋰(較佳為 *n*-丁基鋰)，該烷基鎂試劑較佳為異丙基鎂氯化物(選擇性地以氯化鋰錯合)，接著將式 16 之經取代苯甲醛加入。流程 12 方法係藉由合成實例 5 而說明。或者，式 1b 化合物可藉由使用該項技術中熟知的標準方法(例如在甲醇中的硼氫化鈉或甲醇)來還原式 19 酮而製備。式 19 酮可藉由使相同之式 6 化合物的金屬化吡唑衍生物與式 17 或 18 碳親電子劑反應而製備。反應溫度範圍可在 -90°C 至反應溶劑沸點；溫度在 -78°C 至環境溫度通常為較佳者，而當使用烷基鋰試劑時則溫度在 -78 至 -10°C 為較佳者，而使用烷基鎂試劑時 -20°C 至環境溫度為較佳者。可使用各式不同之溶劑，例如甲苯、乙基醚、四氫呋喃或二甲氧基甲烷；無水四氫呋喃為較佳者。可有利地將第二金屬組分(例如氯化鋅、溴化鋅或單價銅鹽如碘化銅(I)或氰化銅(I))在親電子劑前加入(在該親電子劑為一式 18 化合物之情況下)。式 16、17 與 18 之羰基中間物係市售可得或可藉由該項技術領域中所習知的方法而製備。

流程 12

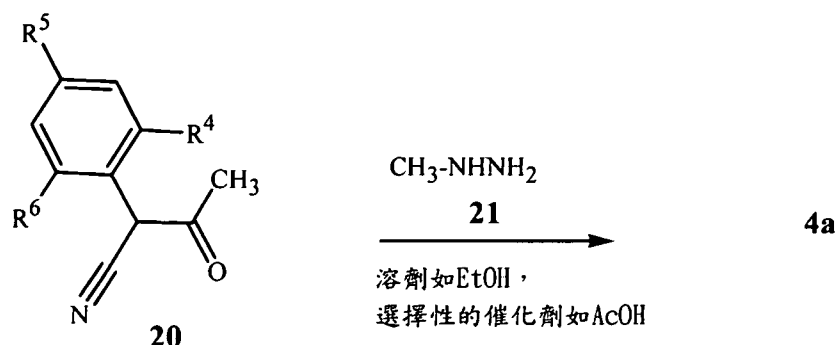


熟悉該項技術領域者會認知到類似於流程 12 中所
示者的反應亦可以在 4 位置缺乏一取代基之吡唑而使
用，因而提供式 13 之某些化合物，其可用於流程 9 所
概述之方法。

可用於製備式 4a 之 5-胺基吡唑的通用方法係為該
項技術所熟知者；請參見如 *Journal für Praktische
Chemie (Leipzig)* 1911, 83, 171 與 *J. Am. Soc.* 1954, 76,

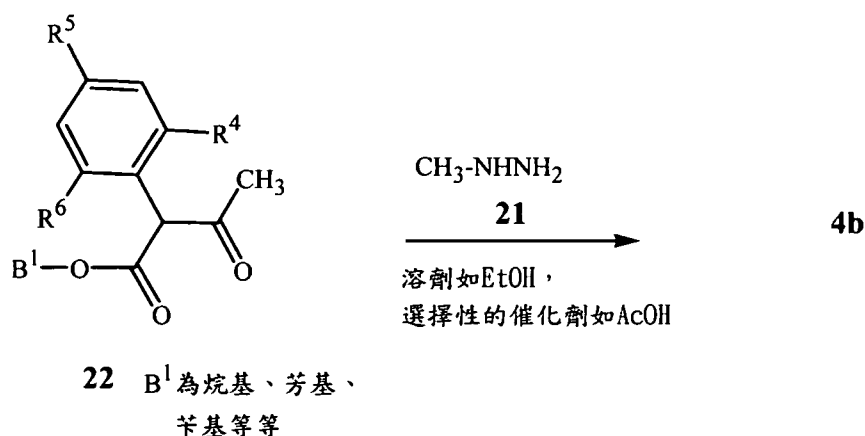
501。此方法係說明於流程 13。流程 13 方法係藉由本合成實例 1 之步驟 A 與本合成實例 2 之步驟 C 而說明。

流程 13



同樣地，可用於製備式 **4b** 之 5-羥基吡唑的通用方法係為該項技術所熟知者；請參見如 *Annalen der Chemie* **1924**, 436, 88。此方法係說明於流程 14。流程 14 方法係藉由本合成實例 6 之之步驟 C 而說明。

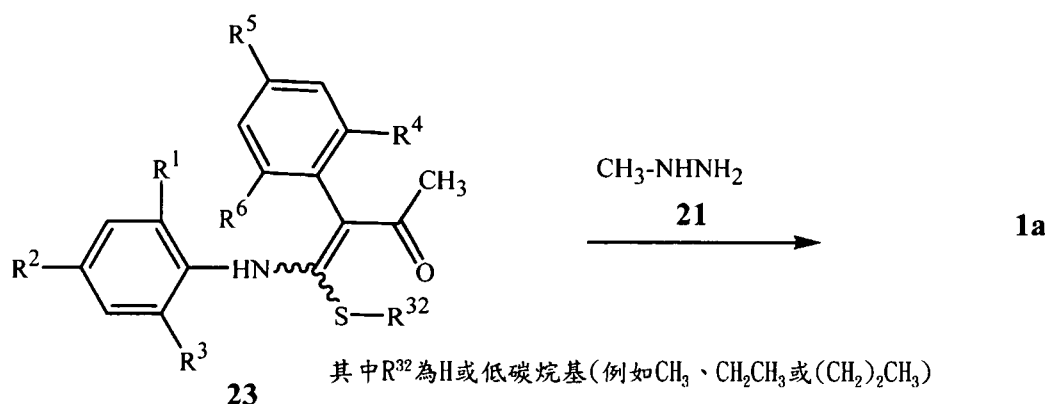
流程 14



如流程 15 所說明，式 **1a** 化合物(即其中 X 為 NH 之式 **1**)可藉由縮合式 **23** 化合物與在溶劑如乙醇或甲醇中之甲肼(式 **21**)而製備，並且此縮合係選擇性地於一酸

或鹼催化劑如乙酸、哌啶或甲氧鈉存在下依據該項技術所習知的通用程序而進行。流程 15 的方法係藉由合成實例 4 之步驟 B 與合成實例 7 之步驟 C 而說明。

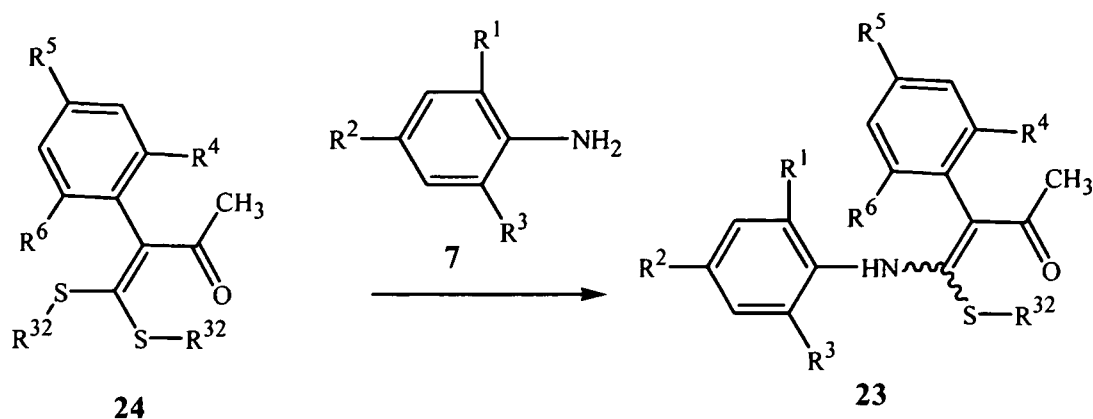
流程 15



在一類似流程 15 方法的方式中，其中 X 為 NH 的式 2 化合物係同樣以肼縮合式 23 化合物而製備。此方法係描述於 *Chemistry of Heterocyclic Compounds* **2005**, 41(1), 105–110。

如流程 16 所示，式 23 化合物(其中 R^{32} 為 H 或低碳烷基如 CH_3 、 CH_2CH_3 或 $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$)可藉由對應之式 24 乙烯酮二硫縮醛與式 7 化合物反應而製備，其反應係選擇性地於例如氫化鈉或乙基鎂氯化物之鹼的存在下，於溶劑如甲苯、四氫呋喃或二甲氧基甲烷中，在溫度範圍在 -10°C 至溶劑沸點下進行。請參見如 *J. Chem.* **1975**, 12(1), 139。可用於製備式 24 之化合物的通用方法係為該項技術所習知者。

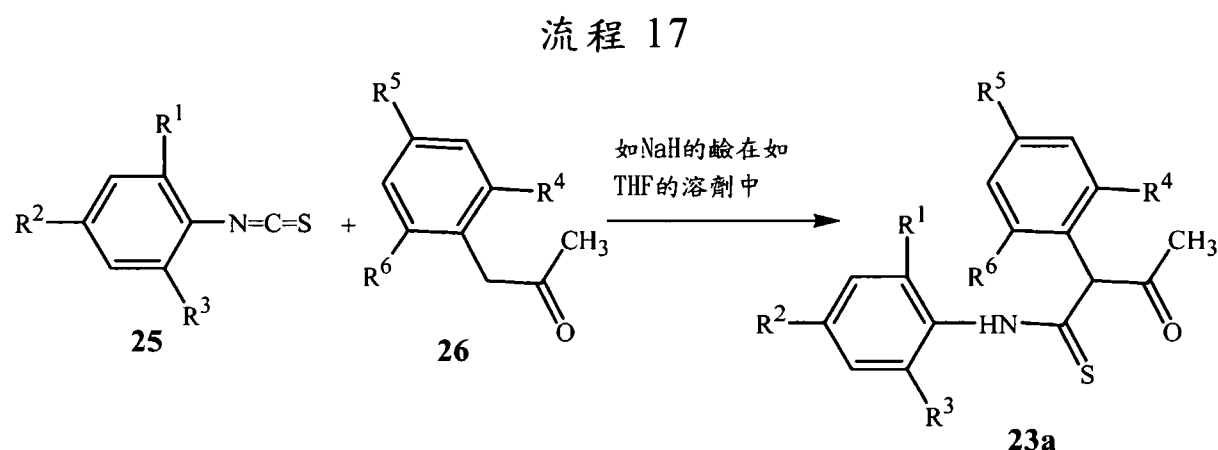
流程 16



其中R³²為H或低碳烷基(例如CH₃、CH₂CH₃或(CH₂)₂CH₃)

如流程 17 所示，式 **23a** 化合物(即其中 R³² 為 H 之式 **23** 互變異構物)可藉由使對應之式 **25** 異硫氰酸酯化合物與式 **26** 芳基丙酮化合物反應而製備；請參見如 *Zhurnal Organicheskoi Khimii* **1982**, 18(12), 2501。可用於此反應之鹼包括氫化鈉、烷氧化物鹼(例如-三級丁氧鉀或乙氧鈉)、氫氧化鉀、氫氧化鈉、碳酸鉀或胺鹼(例如三乙胺或 *N,N*-二異丙基乙胺)。可使用各式不同的溶劑，例如四氫呋喃、乙醚、甲苯、*N,N*-二甲基甲醯胺、醇(例如乙醇)、酯(例如乙酸乙酯或乙酸異丙酯)或其混合物。如該項技術中所熟知者，選擇的溶劑要能與所使用的鹼相容。反應溫度範圍可在-78°C 至溶劑沸點。一種有用之鹼與溶劑混合物為在四氫呋喃中之三級丁氧鉀，其中在-70 至 0°C 下將一式 **25** 異硫氰酸酯與一式 **26** 羰基化合物之溶液加入，其可合併為一溶液或分別加入，較佳為藉由將羰基化合物加入接著將異硫氰酸酯

加入。流程 17 的方法係藉由合成實例 4 之步驟 A 與合成實例 7 之步驟 C 而說明。



式 **23a** 酮硫醯胺可藉由使對應酮醯胺與硫化劑如勞森試劑(Lawesson's reagent)或 P_2S_5 反應而製備；請參見如 *Helv. Act.* **1998**, 81(7), 1207。

熟習該項技術者會認知到各式不同之官能基可轉化為其他者以提供不同之式 1 化合物。例如，用於製備式 1 化合物之中間物可含有芳族硝基基團，其可還原為胺基基團，而後經由該項技術中所熟知的反應如山德邁耳反應(Sandmeyer reaction)轉化為各式不同之鹵化物，而提供式 1 化合物。藉由類似反應，芳族胺(苯胺)可經由重氮鹽轉化為酚，其而後可經烷基化以製備具有烷氧取代基之式 1 化合物。同樣地，透過山德邁耳反應製備的芳族鹵化物如溴化物或碘化物可在銅催化條件下與醇反應，例如烏耳曼反應(Ullmann reaction)或其已知的修飾反應，以提供含有烷氧取代基的式 1 化合物。

此外，一些鹵基如氟或氯可於鹼性條件下經醇置換，以提供含有對應的烷氧取代基的式 1 化合物。

上述反應也可以在許多情況下以交叉的次序進行，例如藉由稍後說明之用於一般製備經取代吡唑的反應，製備用於在流程 2 反應中的 1*H* 吡唑。

已認知到上述用於製備式 1 化合物的一些試劑及反應條件，可能無法與某些存在於中間物中的官能性相容。在這些實例中，結合保護/去保護序列或官能基相互轉換至該合成中，將有助於獲得所欲產物。保護基的使用及選擇對於熟習化學合成之人士將是顯而易見的(請參見如 Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 第 2 版; Wiley: New York, 1991)。熟習該項技術者會認知到，在一些情況下，在引入一特定試劑(如同其在任何個別流程中所述者)後，其可能必須進行未詳述之額外常規步驟以完成式 1 化合物之合成。熟習該項技術者亦會認知到，可能必須以不同於所呈現之特定順序所意味的次序，來進行以上流程中所說明步驟之組合，以製備式 1 化合物。熟習該項技術者亦會認知到，本文中所述之式 1 化合物與中間物可經過各式不同之親電子、親核、自由基、有機金屬、氧化與還原反應以加入取代基或修飾現存之取代基。

即使沒有進一步的闡述，相信使用上述說明的熟習該項技術者仍能夠最大程度地利用本發明。因此，下面的合成實例應理解為僅僅是說明性的，且不得以任何方式作為對本文揭露內容的限制。下列合成實例中的步驟，

說明在整個合成變化中每一步驟的製程，且每個步驟的起始原料不一定非得由在其他實例或步驟中敘述的特別製備流程之製程來製備。百分率為按重量計，除了層析溶劑混合物或另有指明者。除非另有指明，則層析溶劑混合物之份數及百分比係以體積計。 ^1H NMR 光譜係以偏移自在 CDCl_3 中之四甲基矽烷的低場 ppm 來記述，除非另有註明；「s」代表單峰，「m」代表多重峰，「br s」代表寬單峰。質譜(MS)係記述為最高同位素豐度母離子(M+1)之分子量，其係藉由將 H^+ (分子量為 1) 加入至該分子而形成，藉由使用大氣壓力化學離子化(AP^+)的質譜測定法測定，其中「amu」代表原子質量單位。含有一或多個較低豐度之較高原子量同位素(例如 ^{37}Cl 、 ^{81}Br)的分子離子，其出現並未被記述。「LC/MS」係指藉由液相層析術物理分離化學化合物以及藉由質譜測定法分析該已分離化合物之質量的組合。

合成實例 1

4-(2-氯-4-氟苯基)-*N*-(2,6-二氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 3)的製備

步驟 A： 4-[2-氯-4-氟苯基]-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺的製備

將無水固體乙氧鈉(Aldrich, 10.2 g, 150 mmol)在萘(60 mL)與無水乙醇(25 mL)之混合物中的懸浮液在 70°C 下攪拌，並且將 2-氯-4-氟苯乙腈(16.96 g, 100 mmol)在乙酸乙酯(30 mL)與乙醇(5 mL)之混合物中的溶液在 20 分鐘期間滴加至熱反應混合物。將反應混合物在

75–78°C 下加熱 3 小時而後使其冷卻。將水(50 mL)加入以溶解固體。以乙酸乙酯萃取混合物一次並將萃取物拋棄。藉由加入 1 N 鹽酸水溶液將水相酸化至 pH 2，而後以乙酸乙酯(50 mL)萃取。將乙酸乙酯相乾燥(MgSO₄)並蒸發以提供呈固體之中間產物 α -乙醯-2-氯-4-氟苯乙腈(14.8 g)。

將一份以上獲得之產物(4.61 g, 21.8 mmol)在乙醇(15 mL)中攪拌，並且將冰醋酸(3 mL)與甲胛(1.17 mL, 21.8 mol)加入。將此反應混合物攪拌並在回流下加熱整夜。而後在減壓下濃縮反應混合物，並且以乙酸乙酯磨碎所得殘餘物。將所得固體收集在玻璃料上並在空氣中乾燥，以得到呈白色固體之標題化合物(2.42 g)。

¹H NMR δ 7.2–7.3 (m, 2H), 7.0 (m, 1H), 3.7 (s, 3H), 3.4 (br s, 2H), 2.1 (s, 3H). MS: 240 amu (AP⁺)。

步驟 B： 5-溴-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑的製備

將溴化銅(II)(3.94 g, 17.7 mmol)加入至 4-[2-氯-4-氟苯基]-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(即步驟 A 之產物)(2.4 g, 10 mmol)在乙腈(50 mL)中之溶液，並且將混合物攪拌並在冰水浴中冷卻，同時將亞硝酸三級丁酯(90%工業級, 2.33 mL, 17.7 mmol)在 5 分鐘期間以滴加方式加入。使反應混合物緩慢溫熱至環境溫度。將 HCl 水溶液(20 mL)加入，而後將乙酸乙酯(20 mL)加入。透過 Celite[®] 矽藻土助濾劑的 2-cm 襯墊過濾此混合物。以乙酸乙酯(20 mL)洗滌該過濾襯墊並將相分離。以 1.0 N 鹽酸水溶

液與鹽水洗滌有機相，以 MgSO_4 乾燥並濃縮以留下呈橙褐色半固體之標題化合物(2.8 g)。

^1H NMR δ 7.18–7.25 (m, 2H), 7.04 (m, 1H), 3.89 (s, 3H), 2.14 (s, 3H)。

步驟 C： 4-(2-氯-4-氟苯基)-*N*-(2,6-二氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺的製備

將 5-溴-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑(即步驟 B 之產物)(0.20 g, 0.66 mmol)、乙酸鈹(II)(15 mg, 0.066 mmol)、4,5-雙(二苯膦)-9,9-二甲吡啶(4,5-bis(diphenylphosphino)-9,9-dimethylxanthene)(76 mg, 0.13 mmol)與粉末狀碳酸鉀(1.8 g, 13 mmol)合併於無水 1,4-二噁烷(3 mL)中，並且將混合物以 N_2 氣體的液面下氣流鼓泡 10 分鐘。將 2,6-二氟-4-甲氧苯胺(0.22 g, 1.3 mmol)一次性加入，並且將反應混合物在回流下加熱 22 小時。透過 Celite[®] 矽藻土助濾劑過濾該反應混合物，並以乙酸乙酯(20 mL)洗滌過濾襯墊。以水(10 mL)與鹽水(10 mL)洗滌濾液，以 MgSO_4 乾燥，並濃縮以留下半固體狀的殘餘物。藉由管柱層析術將此殘餘物通過 5 g 的矽膠並以己烷/乙酸乙酯(20:1 至 1:3)梯度沖提，以得到呈淺棕色固體之標題化合物(48 mg)。

^1H NMR δ 7.0–7.1 (m, 2H), 6.85 (m, 1H), 6.26 (m, 2H), 4.84 (br s, 1H), 3.78 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 2.08 (s, 3H). MS: 382 amu (AP^+)。

合成實例 2

4-(2,6-二氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-*N*-(2,4,6-三氟苯基)-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 7)的製備

步驟 A： 2,6-二氟-4-甲氧苯乙腈的製備

將 KCN(0.88 g, 13 mmol)溶於水(2 mL)中之溶液加入至水浴冷卻的 2,6-二氟-4-甲氧苄溴(2.50 g, 10.5 mmol)在 *N,N*-二甲基甲醯胺(10 mL)中之溶液。將反應混合物攪拌 20 分鐘。將水(20 mL)加入而後將反應混合物倒入至飽和 NaHCO₃ 水溶液(20 mL)並以乙醚(50 mL)萃取。以水洗滌有機相(5 × 25 mL)，以 MgSO₄ 乾燥，並濃縮以得到一油狀物，其在靜置下結晶以提供呈白色固體之標題化合物(1.9 g)。

¹H NMR δ 6.50 (m, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.65 (s, 2H)。

步驟 B： α-乙醯-2,6-二氟-4-甲氧苯乙腈的製備

將固體乙氧鈉(4.7 g, 66 mmol)在二甲苯(20 mL)與乙醇(10 mL)之混合物中攪拌並加熱至 50°C。將 2,6-二氟-4-甲氧苯乙腈(即步驟 A 之產物)(8.0 g, 44 mmol)在乙酸乙酯(10.4 mL)中之溶液以滴加方式加入。將反應混合物在 50°C 下加熱 4 小時而後使其冷卻至環境溫度。將反應混合物倒入水(100 mL)中並以乙酸乙酯(25 mL)萃取。以 3 N 的 HCl 水溶液將水相酸化至 pH 4 並以乙酸乙酯(100 mL)萃取。以水(50 mL)和鹽水(50 mL)洗滌有機相，然後以 MgSO₄ 乾燥，並濃縮以留下淺棕色半固體之標題化合物(8.0 g)。

^1H NMR δ 6.56 (m, 2H), 4.86 (s, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.40 (s, 3H)。

步驟 C： 4-(2,6-二氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺的製備

將 α -乙醯-2,6-二氟-4-甲氧苯乙腈(即步驟 B 之產物)(8.03 g, 35.7 mmol)與乙酸(5 mL)在乙醇(35 mL)中攪拌，並將甲胛(1.91 mL, 35.7 mmol)加入。將反應混合物回流加熱 16 小時，冷卻並接著倒入水(100 mL)中。以乙酸乙酯(100 mL)萃取所生成的混合物。以 1 N 的 NaOH 水溶液(50 mL)接著以鹽水(50 mL)洗滌有機相，以 MgSO_4 乾燥，並濃縮以留下一固體。將固體溶於甲醇，並將所得溶液溫熱至 45°C。將水(25 mL)以滴加方式加入，並使混合物冷卻。在玻璃料上收集沉澱物以得到呈白色固體之標題化合物(3.88 g)。

^1H NMR δ 6.55 (m, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 3.43 (br s, 2H), 2.09 (s, 3H)。

步驟 D： 5-溴-4-(2,6-二氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑的製備

將溴化銅(II)(3.81 g, 16.9 mmol)加入至 4-(2,6-二氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(即步驟 C 之產物)(3.88 g, 15.4 mmol)在乙腈(50 mL)中之溶液，並將混合物攪拌並在冰水浴中冷卻，同時將亞硝酸三級丁酯(90%工業級, 3.54 mL, 26.9 mmol)以滴加方式在 5 分鐘期間加入。使反應混合物緩慢溫熱至環境溫度。將鹽

酸水溶液(25 mL)加入，接著將乙酸乙酯(25 mL)加入，將所得混合物透過 Celite[®]矽藻土助濾劑的 2-cm 襯墊過濾。以乙酸乙酯(50 mL)洗滌過濾襯墊並將相分離。以 1 N 的 HCl 水溶液(25 mL)和鹽水(25 mL)洗滌有機相，以 MgSO₄ 乾燥並濃縮。將殘餘物通過 24 g 的矽膠管柱層析並以己烷/乙酸乙酯(9:1 到 1:1)梯度沖提而純化，以得到呈白色固體之標題化合物(3.25 g)。

¹H NMR δ 6.54 (m, 2H), 3.88 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 2.16 (s, 3H)。

步驟 E： 4-(2,6-二氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-N-(2,4,6-三氟苯基)-1*H*-吡唑-5-胺的製備

將 5-溴-4-(2,6-二氟-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑(即步驟 D 之產物)(0.30 g, 0.94 mmol)、乙酸鈮(II)(20 mg, 0.090 mmol)、4,5-雙(二苯膦)-9,9-二甲吡啶(0.11 g, 0.19 mmol)與粉末狀之碳酸鉀(2.6 g, 19 mmol)合併於無水 1,4-二噁烷(4 mL)中，並將混合物以 N₂ 氣體的液面下氣流鼓泡 10 分鐘。將 2,4,6-三氟苯胺(0.28 g, 1.9 mmol)一次性加入，並將反應混合物在回流下與氮氣中加熱 22 小時。將反應混合物冷卻，接著透過 Celite[®]矽藻土助濾劑過濾。以乙酸乙酯(20 mL)洗滌過濾襯墊，接著以水(10 mL)和鹽水(10 mL)洗滌濾液，以 MgSO₄ 乾燥，並濃縮以留下半固體殘餘物。藉由管柱層析術將此殘餘物通過 12 g 的矽膠並以己烷/乙酸乙酯(20:1 至 1:3)梯度沖提，以得到呈半固體之標題化合物(73 mg)。

^1H NMR (丙酮- d_6) δ 6.84 (br s, 1H), 6.68 (m, 2H), 6.43 (m, 2H), 3.77 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 1.99 (s, 3H). MS: 384 amu (AP^+)。

合成實例 3

4-[[4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基]氧基]-3,5-二氟苯甲腈(化合物 13)的製備

步驟 A： 4-[(1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基)氧基]-3,5-二氟苯甲腈的製備

將碳酸鉀(1.38 g, 10 mmol)加入至 2,4-二氯-2,5-二甲基-3*H*-吡唑-3-酮(0.70 g, 6.3 mmol)在 *N,N*-二甲基甲醯胺(15 mL)中之溶液。將 3,4,5-三氟苯甲腈(0.94 g, 6.0 mmol)加入，並將反應混合物在 75°C 下在氮氣氛中加熱 16 小時，而後使其冷卻。使反應混合物分配在水(60 mL)與乙酸乙酯(30 mL)間。以水(2 × 30 mL)與鹽水(30 mL)洗滌有機相，以 MgSO_4 乾燥，並濃縮以得到呈黃色油之標題化合物(1.38 g)。

^1H NMR δ 7.36 (m, 2H), 5.24 (s, 1H), 3.78 (s, 3H), 2.16 (s, 3H)。

步驟 B： 3,5-二氯-4-[(4-碘-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基)氧基]苯甲腈的製備

將 4-[(1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基)氧基]-3,5-二氟苯甲腈(即步驟 A 之產物)(1.38 g, 5.5 mmol)在乙腈(20 mL)中之溶液在環境溫度下攪拌，並將 *N*-碘琥珀醯亞胺(1.35 g, 6.0 mmol)一次性加入。將反應混合物在回流下

加熱 2 小時，冷卻，而後倒入水(40 mL)中。以乙酸乙酯(40 mL)萃取所得混合物。以水(20 mL)與飽和 NaHCO_3 水溶液(20 mL)洗滌有機相，以 MgSO_4 乾燥，並在減壓下濃縮以得到呈淺棕色固體之標題化合物(2.1 g)。

^1H NMR (丙酮- d_6) δ 7.80 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 2.09 (s, 3H). MS: 376 amu (AP^+)。

步驟 C： 4-[[4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基]氧基]-3,5-二氟苯甲腈的製備

在 3,5-二氟-4-[(4-碘-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基)氧基]苯甲腈(即步驟 B 之產物)(1.0 g, 2.67 mmol)在 1,4-二噁烷(6 mL)中之溶液中加入 2-氯-4-氟苯硼酸(或者名為 *B*-(2-氯-4-氟苯基)硼酸)(0.93 g, 5.33 mmol)、二氯(雙)三苯基膦鈣(II)(或者名為雙(三苯基膦)鈣(II)二氯)(93 mg, 0.13 mmol)、碳酸鉀(0.74 g, 5.33 mmol)與水(4 mL)。將所得混合物在回流下加熱 5 小時，使其冷卻，並使其分配在水(20 mL)與乙酸乙酯(20 mL)間。以 MgSO_4 乾燥有機層並濃縮。藉由在具有己烷/乙酸乙酯梯度的矽膠上進行層析術而純化殘餘物，以得到呈灰白色固體之標題化合物(110 mg)。

^1H NMR δ 7.00–7.09 (m, 3H), 6.97 (m, 1H), 6.86 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 2.02 (s, 3H)。

合成實例 4

4-(2,4-二氯苯基)-*N*-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 17)的製備步驟 A： α -乙醯-2,4-二氯-*N*-(2,4-二氟苯基)苯乙烷硫醯胺的製備

將異硫氰酸 2,4-二氟苯酯(0.27 mL, 2.0 mmol)加入至氫化鈉(60%在礦物油)(112 mg, 2.8 mmol)在無水四氫呋喃(4 mL)中之經攪拌懸浮液，其係在氮氣氛下在冰水浴中冷卻。將 1-(2,4-二氯苯基)-2-丙酮(570 mg, 2.8 mmol)在四氫呋喃(4 mL)中之溶液以滴加方式在 5 分鐘期間加入。將所得黃色溶液在 5–10°C 下攪拌 1 小時。小心將水(10 mL)加入，並以乙酸乙酯(10 mL)萃取反應混合物。以 1 N 的 HCl 水溶液酸化水相至 pH 3，接著以乙酸乙酯(20 mL)萃取。以水(10 mL)與鹽水(10 mL)洗滌有機萃取物，以 MgSO_4 乾燥，並濃縮以留下一固體。以己烷/乙酸乙酯(2:1)磨碎固體，收集在玻璃料上，並空氣乾燥以得到呈白色固體之標題化合物(240 mg)。MS: 373 amu (AP^+)。

步驟 B： 4-(2,4-二氯苯基)-*N*-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺的製備

將乙酸(50 μL)與甲胛(41 μL)加入至 α -乙醯-2,4-二氯-*N*-(2,4-二氟苯基)苯乙烷硫醯胺(238 mg, 0.64 mmol)在乙醇(4 mL)中之經攪拌懸浮液。將反應混合物在回流下加熱 2 小時並使其冷卻。接著以乙酸乙酯(10 mL)稀

釋該反應混合物並以 1 N 的 NaOH 水溶液(10 mL)、水(10 mL)及鹽水(10 mL)洗滌，以 MgSO_4 乾燥，並濃縮以留下固體殘餘物。藉由管柱層析術將此殘餘物在 5 g 具有己烷/乙酸乙酯(2:1 至 1:1)梯度的矽膠上純化，以得到呈固體之標題化合物(170 mg)。

^1H NMR δ 7.43 (s, 1H), 7.19 (m, 1H), 7.07 (m, 1H), 6.78 (m, 1H), 6.62 (m, 1H), 6.37 (m, 1H), 5.22 (br s, 1H), 3.70 (s, 3H), 2.18 (s, 3H). MS: 368 amu (AP^+)。

合成實例 5

4-(2-氯-4-氟苯基)- α -(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5- 甲醇(化合物 122)的製備

將 5-溴-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑(即合成實例 1 步驟 B 之產物)(0.25 g, 0.82 mmol)溶於無水四氫呋喃(12 mL)中，並將混合物在氮氣氛下在乾冰/丙酮浴中冷卻。將正丁基鋰(2.0 M, 0.49 mL, 0.98 mmol)之己烷溶液以滴加方式在 5 分鐘期間加入。在 15 分鐘後，將 2,4-二氟苯甲醛(0.09 mL, 0.82 mmol)在無水四氫呋喃(3 mL)中之溶液以滴加方式緩慢加入，造成深紅色溶液變淡成黃色。在 45 分鐘後，藉由加入飽和 NH_4Cl 水溶液(~ 20 mL)淬熄反應混合物，並使其溫熱至環境溫度。以乙酸乙酯萃取混合物，並以飽和 NH_4Cl 水溶液(25 mL)及鹽水洗滌有機相，以 Na_2SO_4 乾燥，並濃縮以留下黏性殘餘物。藉由管柱層析術將此殘餘物通過矽膠並以在己烷中之乙酸乙酯(7%至 10%)梯度沖提，以得到呈白色半固體之標題化合物(109 mg)。

^1H NMR δ 7.5 (m, 1H), 7.1 (m, 2H), 7.0 (m, 1H), 6.85 (m, 2H), 6.0 (br s, 1H), 5.9 (s, 1H), 3.8 (s, 3H), 2.1 (s, 3H). MS: 367 amu (AP^+)。

合成實例 6

4-[[1,3-二甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)-1*H*-吡唑-5-基]氧基]-3,5-二氟苯甲腈(化合物 8)的製備

步驟 A： 2,4,6-三氟苯乙酸甲酯的製備

將 2,4,6-三氟苯乙酸(5.00 g, 26.3 mmol)在甲醇(25 mL)中之溶液在環境溫度下攪拌，並將亞硫醯氯(6 mL, ~3 當量)以滴加方式加入，造成反應混合物之溫度達到 60°C。使反應混合物冷卻至環境溫度並攪拌 3 小時。在冰冷卻下將水(25 mL)加入。以乙酸乙酯(2 × 100 mL)萃取混合物。將合併之有機相依序以水(2×)、飽和碳酸氫鈉水溶液與鹽水洗滌，而後乾燥(MgSO_4)。濃縮後提供呈清澈油之標題化合物(5.38 g)。

^1H NMR δ 6.68 (m, 2H), 3.72 (s, 3H), 3.66 (s, 2H)。

步驟 B： α -乙醯-2,4,6-三氟苯乙酸甲酯的製備

在市售購得的鋰雙(三甲矽基)醯胺(1.0 M, 21.0 mL)之四氫呋喃溶液(在氮氣氛中攪拌並冷卻至 -65°C 的內部溫度)中，以滴加方式在 30 分鐘期間將 2,4,6-三氟苯乙酸甲酯(即步驟 A 之產物)(2.04 g, 10.0 mmol)溶於無水四氫呋喃(10 mL)中之溶液加入。將反應混合物攪拌額外 30 分鐘，而後同時維持在 -65°C 之溫度下，將新蒸餾之乙醯氯(0.80 mL, 11 mmol)在無水四氫呋喃(3 mL)

中之溶液以滴加方式加入。使反應混合物緩慢溫熱至環境溫度，而後將水(30 mL)加入。以乙酸乙酯(60 mL)萃取所得混合物。以 1 N 鹽酸酸化水相並以乙酸乙酯(60 mL)萃取。僅保留第一次的乙酸乙酯萃取物，因為薄層層析分析顯示第二次萃取物除了額外所欲之產物外，尚含有明顯的極性雜質。進一步依序以 1 N 鹽酸、水與鹽水洗條第一次的乙酸乙酯萃取物，乾燥(MgSO_4)並濃縮以提供呈清澈油質之標題化合物(1.86 g)。

^1H NMR δ 6.69 (m, 2H), 3.7 (m, 1H and s, 3H), 1.87 (s, 3 H); 在 13.2 ppm 與 4.9 ppm 的次要共振指出有烯醇的互變異構物存在。

步驟 C： 1,3-二甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)-1*H*-吡唑-5-醇的製備

在 α -乙醯-2,4,6-三氟苯乙酸甲酯(即步驟 B 之產物)(2.46 g, 10.0 mmol)在甲醇(15 mL)中之溶液中加入甲胛(0.665 mL, 12.5 mmol)，並將混合物在環境溫度下在 3 天期間攪拌。將檸檬酸水溶液(1 M, 10 mL)加入，而後將水(50 mL)加入。以乙酸乙酯(2×50 mL)萃取混合物。依序以水與鹽水洗滌合併之乙酸乙酯萃取物，乾燥(MgSO_4)並濃縮以留下黃色固體。將此固體懸浮於小體積的乙酸乙酯(~ 5 mL)中，將等體積己烷逐步加入，並將懸浮液攪拌 30 分鐘。將固體組分收集於玻璃料上，以小份量的乙酸乙酯/己烷(1:1 與 1:2 v:v)洗滌，並使其在空氣中乾燥以提供白色固體(1.02 g)。蒸發母液並以如前所述之小體積乙酸乙酯與己烷處理所得殘餘

物，以提供額外 0.13 g 含有標題化合物的固體（總共 1.15 g）。藉由 LC/MS 分析合併之固體顯示主要組分的質量為 242 (AP^+)而次要組分(後續以逆相 LC 洗提而得)之質量亦為 242 (AP^+)，因此為標題化合物之位向異構物。表觀組分比例為 94 : 6。

^1H NMR (丙酮- d_6) δ 6.95 (m, 2H), 3.52 (s, 3H), 1.98 (s, 3H); 5-羥基共振在此溶劑中未觀察到。

步驟 D: 4-[[1,3-二甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)-1*H*-吡唑-5-基]氧基]-3,5-二氟苯甲腈的製備

將 1,3-二甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)-1*H*-吡唑-5-醇(即步驟 C 之產物)(104 mg, 0.43 mmol)在無水 *N,N*-二甲基甲醯胺(2.5 mL)中之溶液在冰水浴中在氮氣氛下冷卻，並將氫化鈉(60%在礦物油中之懸浮液，20 mg, 0.46 mmol)一次性加入。在 15 分鐘後，將 3,4,5-三氟苯甲腈(101 mg, 0.64 mmol)一次性加入。使反應混合物達到環境溫度，而後將其在 40°C 下加熱 2.5 小時。將水(~ 10 mL)加入，並以乙酸乙酯(2 × ~ 10 mL)萃取混合物。依序以水(3 × 10 mL)與鹽水洗滌合併之乙酸乙酯萃取物，乾燥(MgSO_4)並在減壓下濃縮。在矽膠(5 g)上之層析術(以己烷-乙酸乙酯之 2:1 混合物洗提)結果顯示，產物(51 mg)含有以 92:8 混合物(及其位向異構物)比例之標題化合物。

^1H NMR δ 7.1 (m, 2H), 6.5–6.6 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 2.05 (s, 3H). MS: 380 amu (AP^+)。

合成實例 7

4-(2-溴-4-氟苯基)-*N*-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺(化合物 240)的製備

步驟 A： 1-(2-溴-4-氟苯基)-2-丙酮的製備

將甲氧鈉在甲醇(25%，34 mL，157 mmol)中之溶液與甲苯(200 mL)合併。而後將甲醇在 90°C 下使用迪安-斯塔克分離器(Dean-Stark trap)蒸餾移除。在溶液冷卻至 70°C 後，將溶於乙酸乙酯(40 mL)之 2-溴-4-氟苯乙腈(21.4 g, 100 mmol)由滴液漏斗在 20 分鐘期間加入(在機械攪拌下)。在此時點，將額外之甲苯(150 mL)加入以利於大量淺紫色沉澱物之攪拌。將反應混合物倒入水中，並將有機相分離。將水相酸化並以乙酸乙酯萃取。將乙酸乙酯相在減壓下乾燥並濃縮以提供呈原油之中間化合物 α -乙醯-2-溴-4-氟苯乙腈。

將原油溶於硫酸(60%，170 mL)中並回流 6.5 小時。而後以己烷(2 × 100 mL)萃取反應混合物，並以水與鹽水洗滌合併之己烷萃取物，乾燥(MgSO₄)並在減壓下濃縮，以產生呈黃色油之標題化合物(14.7 g)，其未經進一步純化即用於步驟 C。

¹H NMR δ 7.33 (m, 1H), 7.18 (m, 1H), 7.01 (m, 1H), 3.85 (s, 2H), 2.23 (s, 3H)。

步驟 B： 1- 氯 -3- 氟 -2- 異 硫 氰 基 苯
(1-Chloro-3-fluoro-2-isothiocyanatobenzene)
的製備

在 2-氯-6-氟苯胺(5.0 g, 34 mmol)在氯苯(52 mL)中之溶液中加入二氯化硫羰(硫光氣)(5.1 g, 45 mmol)與 DMF (0.27 mL)。將反應混合物回流 2 小時而後濃縮以留下呈棕色油之標題化合物(6.15 g)，其未經進一步純化即用於步驟 C。

^1H NMR δ 7.18 (m, 2H), 7.07 (m, 1H)。

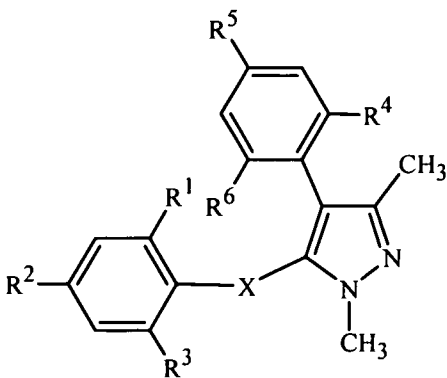
步驟 C： 4-(2-溴-4-氟苯基)-*N*-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺的製備

在三級丁氧鉀(0.41 g, 3.3 mmol)在 THF(20 mL)中之溶液中在 0°C 下加入 1-(2-溴-4-氟苯基)-2-丙酮(即步驟 A 之產物)(0.70 g, 3.0 mmol)在 THF(10 mL)中之溶液(在 5 分鐘期間)。持續攪拌 1 小時而後將溫度降低至 -10°C。將 1-氯-3-氟-2-異硫氰基苯(即步驟 B 之產物)(0.57 g, 3.0 mmol)在 THF(10 mL)中之溶液在 6 分鐘期間加入，並持續攪拌 15 分鐘。將碘甲烷(0.54 g, 3.8 mmol)加入，並將冷卻浴移除以提供含有中間化合物 α -乙醯-2-溴-*N*-(2-氯-6-氟苯基)-4-氟苯乙烷硫醯胺之反應混合物。在 5 分鐘後，將水(0.2 mL, 11 mmol)、冰醋酸(0.53 mL, 9.1 mmol)與甲胛(0.81 mL, 15 mmol)快速連續加入，並將反應混合物加熱回流 6 小時。而後將粗反應混合物在減壓下濃縮並以 MPLC(以 0 至 100%在己烷中之乙酸乙酯作為洗提液)純化，以提供標題產物，其為呈灰白色固體之本發明化合物(0.55 g)。

^1H NMR δ 7.24 (m, 1H), 7.04 (m, 1H), 6.95 (m, 1H), 6.87 (m, 1H), 6.78 (m, 1H), 6.68 (m, 1H), 5.45 (d, 1H), 3.80 (s, 3H), 2.10 (s, 3H)。

藉由本文中所述製程連同該領域中習知的方法，可製備出下表中揭露的化合物。下述為表中所使用的縮寫，其如下：Me 代表甲基，MeO 代表甲氧基，EtO 代表乙氧基，而 CN 代表氰基。因為對稱的關係，若 R^1 、 R^3 、 R^4 與 R^6 之定義許可，則 R^1 可與 R^3 互換，而 R^4 可與 R^6 互換。

表 1



R^4 為 F、 R^5 為 H、 R^6 為 H，而 X 為 NH。

R^1	R^2	R^3	R^1	R^2	R^3
F	H	H	F	H	F
F	F	H	F	F	F
F	CN	F	F	MeO	F
F	EtO	F	F	Cl	H
F	Cl	Cl	F	H	Cl
F	Br	H	F	H	Br
F	Cl	F	F	Br	F

R ¹	R ²	R ³	R ¹	R ²	R ³
F	I	H	F	F	I
F	I	F	F	CN	H
F	MeO	H	F	EtO	H
Cl	H	H	Cl	H	Cl
Cl	Cl	H	Cl	Cl	Cl
Cl	CN	Cl	Cl	MeO	Cl
Cl	EtO	Cl	Cl	F	H
Cl	F	F	Cl	F	Cl
Cl	Br	H	Cl	H	Br
Cl	Br	Br	Cl	Br	Cl
Cl	I	H	Cl	CN	H
Cl	MeO	H	Cl	EtO	H
Br	H	H	Br	F	H
Br	Cl	H	Br	Br	H
Br	F	F	Br	Br	F
Br	Cl	F	Br	F	Cl
Br	Cl	Cl	Br	F	Br
Br	CN	Br	Br	MeO	Br
Br	EtO	Br	Br	CN	H
Br	MeO	H	Br	EtO	H
Br	I	H	I	H	H
I	F	H	I	F	F
I	Cl	F	I	Cl	Cl
Br	H	Cl	Br	H	Br
I	H	F	I	H	Cl
Me	H	H	Me	H	F
Me	F	H	Me	F	F
Me	CN	F	Me	MeO	F
Me	EtO	F	Me	Cl	H
Me	Cl	Cl	Me	H	Cl
Me	Br	H	Me	H	Br
Me	Cl	F	Me	Br	F
Me	I	H	Me	F	I
Me	I	F	Me	CN	H
Me	MeO	H	Me	EtO	H
Me	H	Me	Me	Cl	Me

本揭露亦包括表 2 至 180，各皆以與上表 1 相同的方式建構，除了在表 1 之列標題(即「 R^4 為 F、 R^5 為 H、 R^6 為 H，而 X 為 NH。」)係以下示之各別列標題取代。例如在表 2 中，其列標題為「 R^4 為 F、 R^5 為 H、 R^6 為 F，而 X 為 NH。」，而 R^4 、 R^5 與 R^6 係如上表 1 中所定義者。因此，表 2 中之第一個項目具體揭露 4-(2,6-二氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺)。

表	列標題	表	列標題
2	R^4 為 F, R^5 為 H, R^6 為 F, 而 X 為 NH.	92	R^4 為 Cl, R^5 為 F, R^6 為 H, 而 X 為 O.
3	R^4 為 F, R^5 為 H, R^6 為 Cl, 而 X 為 NH.	93	R^4 為 Cl, R^5 為 F, R^6 為 Cl, 而 X 為 O.
4	R^4 為 F, R^5 為 H, R^6 為 Br, 而 X 為 NH.	94	R^4 為 Cl, R^5 為 I, R^6 為 H, 而 X 為 O.
5	R^4 為 F, R^5 為 Br, R^6 為 H, 而 X 為 NH.	95	R^4 為 Cl, R^5 為 EtO, R^6 為 Cl, 而 X 為 O.
6	R^4 為 F, R^5 為 Br, R^6 為 F, 而 X 為 NH.	96	R^4 為 Cl, R^5 為 EtO, R^6 為 H, 而 X 為 O.
7	R^4 為 F, R^5 為 Cl, R^6 為 Cl, 而 X 為 NH.	97	R^4 為 Cl, R^5 為 MeO, R^6 為 Cl, 而 X 為 O.
8	R^4 為 F, R^5 為 Cl, R^6 為 F, 而 X 為 NH.	98	R^4 為 Cl, R^5 為 MeO, R^6 為 H, 而 X 為 O.
9	R^4 為 F, R^5 為 Cl, R^6 為 H, 而 X 為 NH.	99	R^4 為 Br, R^5 為 H, R^6 為 H, 而 X 為 O.
10	R^4 為 F, R^5 為 -CN, R^6 為 F, 而 X 為 NH.	100	R^4 為 Br, R^5 為 Br, R^6 為 H, 而 X 為 O.
11	R^4 為 F, R^5 為 -CN, R^6 為 H, 而 X 為 NH.	101	R^4 為 Br, R^5 為 Br, R^6 為 F, 而 X 為 O.
12	R^4 為 F, R^5 為 F, R^6 為 H, 而 X 為 NH.	102	R^4 為 Br, R^5 為 Cl, R^6 為 H, 而 X 為 O.
13	R^4 為 F, R^5 為 F, R^6 為 F, 而 X 為 NH.	103	R^4 為 Br, R^5 為 Cl, R^6 為 F, 而 X 為 O.
14	R^4 為 F, R^5 為 F, R^6 為 I, 而 X 為 NH.	104	R^4 為 Br, R^5 為 Cl, R^6 為 Cl, 而 X 為 O.
15	R^4 為 F, R^5 為 I, R^6 為 H, 而 X 為 NH.	105	R^4 為 Br, R^5 為 CN, R^6 為 Br, 而 X 為 O.
16	R^4 為 F, R^5 為 I, R^6 為 F, 而 X 為	106	R^4 為 Br, R^5 為 CN, R^6 為 H, 而 X

表	列標題	表	列標題
	NH.		為 O.
17	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 EtO, R ⁶ 為 F, 而 X 為 NH.	107	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 F, 而 X 為 O.
18	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 EtO, R ⁶ 為 H, 而 X 為 NH.	108	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 H, 而 X 為 O.
19	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 MeO, R ⁶ 為 F, 而 X 為 NH.	109	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 O.
20	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 MeO, R ⁶ 為 H, 而 X 為 NH.	110	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 Br, 而 X 為 O.
21	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 H, R ⁶ 為 H, 而 X 為 NH.	111	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 I, R ⁶ 為 H, 而 X 為 O.
22	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 H, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 NH.	112	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 EtO, R ⁶ 為 Br, 而 X 為 O.
23	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 H, R ⁶ 為 Br, 而 X 為 NH.	113	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 EtO, R ⁶ 為 H, 而 X 為 O.
24	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 Br, R ⁶ 為 H, 而 X 為 NH.	114	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 MeO, R ⁶ 為 Br, 而 X 為 O.
25	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 Br, R ⁶ 為 Br, 而 X 為 NH.	115	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 MeO, R ⁶ 為 H, 而 X 為 O.
26	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 Br, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 NH.	116	R ⁴ 為 I, R ⁵ 為 H, R ⁶ 為 H, 而 X 為 O.
27	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 Cl, R ⁶ 為 H, 而 X 為 NH.	117	R ⁴ 為 I, R ⁵ 為 Cl, R ⁶ 為 F, 而 X 為 O.
28	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 Cl, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 NH.	118	R ⁴ 為 I, R ⁵ 為 Cl, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 O.
29	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 -CN, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 NH.	119	R ⁴ 為 I, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 H, 而 X 為 O.
30	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 -CN, R ⁶ 為 H, 而 X 為 NH.	120	R ⁴ 為 I, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 F, 而 X 為 O.
31	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 F, 而 X 為 NH.	121	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 H, R ⁶ 為 H, 而 X 為 CHOH.
32	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 H, 而 X 為 NH.	122	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 H, R ⁶ 為 F, 而 X 為 CHOH.
33	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 NH.	123	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 H, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 CHOH.
34	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 I, R ⁶ 為 H, 而 X 為 NH.	124	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 H, R ⁶ 為 Br, 而 X 為 CHOH.
35	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 EtO, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 NH.	125	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 Br, R ⁶ 為 H, 而 X 為 CHOH.
36	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 EtO, R ⁶ 為 H, 而 X 為 NH.	126	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 Br, R ⁶ 為 F, 而 X 為 CHOH.

- 37 R^4 為 Cl, R^5 為 MeO, R^6 為 Cl, 而 X 為 NH.
- 38 R^4 為 Cl, R^5 為 MeO, R^6 為 H, 而 X 為 NH.
- 39 R^4 為 Br, R^5 為 H, R^6 為 H, 而 X 為 NH.
- 40 R^4 為 Br, R^5 為 Br, R^6 為 H, 而 X 為 NH.
- 41 R^4 為 Br, R^5 為 Br, R^6 為 F, 而 X 為 NH.
- 42 R^4 為 Br, R^5 為 Cl, R^6 為 H, 而 X 為 NH.
- 43 R^4 為 Br, R^5 為 Cl, R^6 為 F, 而 X 為 NH.
- 44 R^4 為 Br, R^5 為 Cl, R^6 為 Cl, 而 X 為 NH.
- 45 R^4 為 Br, R^5 為 -CN, R^6 為 Br, 而 X 為 NH.
- 46 R^4 為 Br, R^5 為 -CN, R^6 為 H, 而 X 為 NH.
- 47 R^4 為 Br, R^5 為 F, R^6 為 F, 而 X 為 NH.
- 48 R^4 為 Br, R^5 為 F, R^6 為 H, 而 X 為 NH.
- 49 R^4 為 Br, R^5 為 F, R^6 為 Cl, 而 X 為 NH.
- 50 R^4 為 Br, R^5 為 F, R^6 為 Br, 而 X 為 NH.
- 51 R^4 為 Br, R^5 為 I, R^6 為 H, 而 X 為 NH.
- 52 R^4 為 Br, R^5 為 EtO, R^6 為 Br, 而 X 為 NH.
- 53 R^4 為 Br, R^5 為 EtO, R^6 為 H, 而 X 為 NH.
- 54 R^4 為 Br, R^5 為 MeO, R^6 為 Br, 而 X 為 NH.
- 55 R^4 為 Br, R^5 為 MeO, R^6 為 H, 而 X 為 NH.
- 56 R^4 為 I, R^5 為 H, R^6 為 H, 而 X 為 NH.
- 57 R^4 為 I, R^5 為 Cl, R^6 為 F, 而 X 為 NH.
- 58 R^4 為 I, R^5 為 Cl, R^6 為 Cl, 而 X 為 NH.
- 127 R^4 為 F, R^5 為 Cl, R^6 為 Cl, 而 X 為 CHOH.
- 128 R^4 為 F, R^5 為 Cl, R^6 為 F, 而 X 為 CHOH.
- 129 R^4 為 F, R^5 為 Cl, R^6 為 H, 而 X 為 CHOH.
- 130 R^4 為 F, R^5 為 CN, R^6 為 F, 而 X 為 CHOH.
- 131 R^4 為 F, R^5 為 CN, R^6 為 H, 而 X 為 CHOH.
- 132 R^4 為 F, R^5 為 F, R^6 為 H, 而 X 為 CHOH.
- 133 R^4 為 F, R^5 為 F, R^6 為 F, 而 X 為 CHOH.
- 134 R^4 為 F, R^5 為 F, R^6 為 I, 而 X 為 CHOH.
- 135 R^4 為 F, R^5 為 I, R^6 為 H, 而 X 為 CHOH.
- 136 R^4 為 F, R^5 為 I, R^6 為 F, 而 X 為 CHOH.
- 137 R^4 為 F, R^5 為 EtO, R^6 為 F, 而 X 為 CHOH.
- 138 R^4 為 F, R^5 為 EtO, R^6 為 H, 而 X 為 CHOH.
- 139 R^4 為 F, R^5 為 MeO, R^6 為 F, 而 X 為 CHOH.
- 140 R^4 為 F, R^5 為 MeO, R^6 為 H, 而 X 為 CHOH.
- 141 R^4 為 Cl, R^5 為 H, R^6 為 H, 而 X 為 CHOH.
- 142 R^4 為 Cl, R^5 為 H, R^6 為 Cl, 而 X 為 CHOH.
- 143 R^4 為 Cl, R^5 為 H, R^6 為 Br, 而 X 為 CHOH.
- 144 R^4 為 Cl, R^5 為 Br, R^6 為 H, 而 X 為 CHOH.
- 145 R^4 為 Cl, R^5 為 Br, R^6 為 Br, 而 X 為 CHOH.
- 146 R^4 為 Cl, R^5 為 Br, R^6 為 Cl, 而 X 為 CHOH.
- 147 R^4 為 Cl, R^5 為 Cl, R^6 為 H, 而 X 為 CHOH.
- 148 R^4 為 Cl, R^5 為 Cl, R^6 為 Cl, 而 X 為 CHOH.

59	R ⁴ 為 I, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 H, 而 X 為 NH.	149	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 CN, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 CHOH.
60	R ⁴ 為 I, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 F, 而 X 為 NH.	150	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 CN, R ⁶ 為 H, 而 X 為 CHOH.
61	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 H, R ⁶ 為 H, 而 X 為 O.	151	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 F, 而 X 為 CHOH.
62	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 H, R ⁶ 為 F, 而 X 為 O.	152	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 H, 而 X 為 CHOH.
63	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 H, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 O.	153	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 CHOH.
64	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 H, R ⁶ 為 Br, 而 X 為 O.	154	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 I, R ⁶ 為 H, 而 X 為 CHOH.
65	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 Br, R ⁶ 為 H, 而 X 為 O.	155	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 EtO, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 CHOH.
66	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 Br, R ⁶ 為 F, 而 X 為 O.	156	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 EtO, R ⁶ 為 H, 而 X 為 CHOH.
67	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 Cl, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 O.	157	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 MeO, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 CHOH.
68	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 Cl, R ⁶ 為 F, 而 X 為 O.	158	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 MeO, R ⁶ 為 H, 而 X 為 CHOH.
69	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 Cl, R ⁶ 為 H, 而 X 為 O.	159	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 H, R ⁶ 為 H, 而 X 為 CHOH.
70	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 CN, R ⁶ 為 F, 而 X 為 O.	160	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 Br, R ⁶ 為 H, 而 X 為 CHOH.
71	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 CN, R ⁶ 為 H, 而 X 為 O.	161	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 Br, R ⁶ 為 F, 而 X 為 CHOH.
72	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 H, 而 X 為 O.	162	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 Cl, R ⁶ 為 H, 而 X 為 CHOH.
73	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 F, 而 X 為 O.	163	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 Cl, R ⁶ 為 F, 而 X 為 CHOH.
74	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 I, 而 X 為 O.	164	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 Cl, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 CHOH.
75	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 I, R ⁶ 為 H, 而 X 為 O.	165	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 CN, R ⁶ 為 Br, 而 X 為 CHOH.
76	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 I, R ⁶ 為 F, 而 X 為 O.	166	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 CN, R ⁶ 為 H, 而 X 為 CHOH.
77	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 EtO, R ⁶ 為 F, 而 X 為 O.	167	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 F, 而 X 為 CHOH.
78	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 EtO, R ⁶ 為 H, 而 X 為 O.	168	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 H, 而 X 為 CHOH.
79	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 MeO, R ⁶ 為 F, 而 X 為 O.	169	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 CHOH.
80	R ⁴ 為 F, R ⁵ 為 MeO, R ⁶ 為 H, 而 X 為 O.	170	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 Br, 而 X 為 CHOH.

表	列標題	表	列標題
81	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 H, R ⁶ 為 H, 而 X 為 O.	171	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 I, R ⁶ 為 H, 而 X 為 CHOH.
82	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 H, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 O.	172	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 EtO, R ⁶ 為 Br, 而 X 為 CHOH.
83	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 H, R ⁶ 為 Br, 而 X 為 O.	173	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 EtO, R ⁶ 為 H, 而 X 為 CHOH.
84	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 Br, R ⁶ 為 H, 而 X 為 O.	174	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 MeO, R ⁶ 為 Br, 而 X 為 CHOH.
85	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 Br, R ⁶ 為 Br, 而 X 為 O.	175	R ⁴ 為 Br, R ⁵ 為 MeO, R ⁶ 為 H, 而 X 為 CHOH.
86	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 Br, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 O.	176	R ⁴ 為 I, R ⁵ 為 H, R ⁶ 為 H, 而 X 為 CHOH.
87	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 Cl, R ⁶ 為 H, 而 X 為 O.	177	R ⁴ 為 I, R ⁵ 為 Cl, R ⁶ 為 F, 而 X 為 CHOH.
88	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 Cl, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 O.	178	R ⁴ 為 I, R ⁵ 為 Cl, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 CHOH.
89	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 CN, R ⁶ 為 Cl, 而 X 為 O.	179	R ⁴ 為 I, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 H, 而 X 為 CHOH.
90	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 CN, R ⁶ 為 H, 而 X 為 O.	180	R ⁴ 為 I, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 F, 而 X 為 CHOH.
91	R ⁴ 為 Cl, R ⁵ 為 F, R ⁶ 為 F, 而 X 為 O.		

製劑/效用

一種選自式 1 化合物、其 *N*-氧化物及其鹽之化合物，或者一種混合物(即組成物)，其包含該化合物以及至少一種如發明內容中所述之額外殺真菌化合物，通常會用以在進一步組成物(即製劑)中提供殺真菌活性成分，並具有至少一種選自表面活性劑、固體稀釋劑與液體稀釋劑之額外組分，其作為載體。選擇可與活性成分的物理性質，施用模式以及環境因子例如土壤類型、溼度與溫度搭配的製劑或組成物成分。

組分(a)(即至少一種式 1 化合物、其 *N*-氧化物或其鹽)與組分(b)(例如選自如上所述之(b1)至(b46)及其鹽

者)與/或一或多種其他生物活性化合物或藥劑(即殺蟲劑、其他殺真菌劑、殺線蟲劑、殺蟎劑、除草劑以及其他生物藥劑)之混合物可以數種方式來配製，包括：

(i) 組分(a)、組分(b)與/或一或多種其他生物活性化合物或藥劑可分開配製並分開施用，或以合適之重量比例同時施用，例如以桶混劑施用；或者

(ii) 組分(a)、組分(b)與/或一或多種其他生物活性化合物或藥劑可以合適之重量比例一起配製。

有用的製劑包括液體及固體組成物。液體組成物包括溶液(包括可乳化濃縮物)、懸浮液、乳液(包括微乳液與/或懸浮乳液(suspoemulsion))與類似者，並可選擇性地將其增稠成凝膠。水性液體組成物的一般類型為可溶濃縮物(soluble concentrate)、懸浮濃縮物(suspension concentrate)、膠囊懸浮液(capsule suspension)、濃縮乳液、微乳液和懸浮乳液。非水性液體組成物的一般類型為可乳化濃縮物、可微乳化濃縮物、可分散性濃縮物(dispersible concentrate)及油分散液(oil dispersion)。

固體組成物的一般類型為塵粉(dust)、粉劑、粒劑、丸劑(pellet)、珠劑(prill)、錠劑(pastille)、片劑、包膜(filled film)(包括種子塗覆物)與類似者，其可具有水分散性(「可濕性」)或水溶性。由成膜溶液或可流動懸浮液形成的膜和塗層在種子處理上特別有用。活性成分可以經(微)膠囊化並進一步形成懸浮液或固體製劑；或者活性成分的整體製劑可以經膠囊化(或具「保護膜」)。膠囊化可以控制或減緩活性成分的釋放。可乳化粒劑結合了

可乳化濃縮物與乾粒狀製劑的優點。高強度組成物主要用作進一步製劑的中間物。

值得注意的是一組成物實施例，其中包含一式 1 化合物(或一其 *N*-氧化物或其鹽)之固體組成物的粒劑係與一包含組分(b)之固體組成物的粒劑混合。這些混合物可以進一步與包括額外農業用保護劑的粒劑混合。或者，兩或多種的農業用保護劑(例如，一組分(a)(式 1)化合物、一組分(b)化合物、一非組分(a)或(b)的農業用保護劑)可結合在一組粒劑的固體組成物中，其而後與包含一或多種額外農業用保護劑之固體組成物的一或多組的粒劑混合。這些粒劑混合物可依據 PCT 專利公開第 WO 94/24861 號中揭露的一般粒劑混合物，或較佳為依據美國專利第 6,022,552 號教示的均質粒劑混合物。

可噴灑製劑通常在噴灑前會先在適合的介質中擴展。此類液體及固體製劑係配製為可迅速稀釋於噴灑介質(通常是水)中。噴灑的量可從每公頃約一到數千公升，但更通常為從每公頃約十到數百公升。可噴灑製劑可在桶中與水或其他適合介質混合，藉由空中或地面施用而運用於葉處理，或施用於植物的生長介質。液體製劑與乾製劑可在播種時，直接計量加入滴流灌溉系統或犁溝。液體和固體製劑可以施用於作物和其他所欲植物的種子，作為播種前種子處理之用，以透過系統性吸收保護發育中的根及其它地下的植物部分與/或葉。

該製劑通常含有有效量的活性成分、稀釋劑和表面活性劑，其落於在下列概略範圍中且重量加起來會等於百分之百。

重量百分比			
	活性成分	稀釋劑	表面活性劑
水分散性粒劑及水溶性粒劑、片劑及粉劑	0.001-90	0-99.999	0-15
油分散液、懸浮液、乳液、溶液(包括可乳化濃縮物)	1-50	40-99	0-50
塵粉	1-25	70-99	0-5
粒劑與丸劑	0.001-99	5-99.999	0-15
高強度組成物	90-99	0-10	0-2

固體稀釋劑包括例如，黏土如膨土、微晶高嶺石、厄帖浦石與高嶺土、石膏、纖維素、二氧化鈦、氧化鋅、澱粉、糊精、糖(例如乳糖、蔗糖)、二氧化矽、滑石、雲母、矽藻土、尿素、碳酸鈣、碳酸鈉與碳酸氫鈉及硫酸鈉。典型固體稀釋劑係描述於 Watkins 等人，*Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*，第 2 版，Dorland Books，Caldwell，New Jersey 中。

液體稀釋劑包括例如水、*N,N*-二甲基烷醯胺(例如 *N,N*-二甲基甲醯胺)、萆烯、二甲亞砷、*N*-烷基吡咯啉酮(例如，*N*-甲基吡咯啉酮)、乙二醇、三甘醇、丙二醇、二丙烯甘醇、聚丙二醇、碳酸伸丙酯、碳酸伸丁酯、石蠟(例如，白礦油、正構烷烴、異烷烴)、烷基苯、烷基萘、甘油、三乙酸甘油酯(glycerol triacetate)、山梨糖醇、三乙醯甘油(triacetin)、芳烴、脫芳香脂族、烷基苯、烷

基萘、例如環己酮、2-庚酮、異佛酮及 4-羥基-4-甲基-2-戊酮的酮、例如乙酸異戊酯、乙酸己酯、乙酸庚酯、乙酸辛酯、乙酸壬酯、乙酸十三酯及乙酸異莰酯的乙酸酯、例如烷化乳酸酯(alkylated lactate ester)、二元酯及 γ -丁內酯的其他酯類、以及醇類，其可為線性、分支、飽和或不飽和，如甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、正己醇、2-乙基己醇、正辛醇、癸醇、異癸醇、異十八醇、鯨蠟醇、月桂醇、十三醇、油醇、環己醇、四氫糠醇、二丙酮醇及苯甲醇。液體稀釋劑也包括飽和和不飽和脂肪酸的甘油酯(通常為 C_6-C_{22})，如植物種子和水果油(例如橄欖、蓖麻、亞麻仁、芝麻、玉米、花生、向日葵、葡萄籽、紅花、棉籽、黃豆、油菜籽、椰子和棕櫚仁的油)、動物源性脂肪(例如牛油、豬肉脂、豬油、鱈魚肝油、魚油)及其混合物。液體稀釋劑也包括烷化脂肪酸(例如甲基化、乙基化、丁基化)，其中該脂肪酸可藉由水解來自植物和動物來源的甘油酯而獲得，並可用蒸餾純化。典型的液體稀釋劑係描述於 Marsden, *Solvents Guide*, 第 2 版, Interscience, New York, 1950 中。

本發明的固體和液體組成物通常包括一或多種表面活性劑。當加入至液體中時，表面活性劑(也已知為「界面活性劑」)通常會改變(最常為減少)液體的表面張力。取決於表面活性劑分子中親水性和親油性基的性質，表面活性劑可用作為潤濕劑、分散劑、乳化劑或消泡劑。

表面活性劑可以分類為非離子性、陰離子性或陽離子性。對本組成物有用之非離子表面活性劑包括但不限於：醇烷氧化物(alcohol alkoxylate)如基於天然以及合成醇之醇烷氧化物(其可能為分枝或線性)以及由醇以及環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物製備而得者；胺乙氧化物、烷醇醯胺以及乙氧基化烷醇醯胺；烷氧基化三酸甘油酯，例如乙氧基化黃豆、蓖麻以及油菜籽油；烷基酚烷氧化物，如辛苯酚乙氧化物、壬基苯酚乙氧化物、二壬基苯酚乙氧化物以及十二烷基苯酚乙氧化物(由酚類以及環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物製備而得者)；由環氧乙烷或環氧丙烷製備而得之嵌段聚合物以及反向嵌段聚合物，其終端嵌段係由環氧丙烷製備而得；乙氧基化脂肪酸；乙氧基化脂肪酯以及油脂；乙氧基化甲基酯；乙氧基化三苯乙烯苯酚(包括由環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物製備而得者)；脂肪酸酯、甘油酯、羊毛脂基衍生物、聚乙氧化物酯，例如聚乙氧基化山梨醇酐脂肪酸酯、聚乙氧基化山梨糖醇脂肪酸酯以及聚乙氧基化甘油脂肪酸酯；其他山梨醇酐衍生物，例如山梨醇酐酯；聚合性表面活性劑，例如隨機共聚物、嵌段共聚物、醇酸 peg(聚乙二醇)樹脂、接枝或梳狀聚合物以及星狀聚合物；聚乙二醇(peg)聚乙二醇脂肪酸酯；聚矽氧基表面活性劑；以及糖衍生物，例如蔗糖酯、烷基多糖苷以及烷基多糖。

有用的陰離子表面活性劑包括但不限於：烷芳基磺酸以及其鹽；羧基化醇或烷基酚乙氧化物；二苯基磺酸鹽衍生物；木質素以及木質素衍生物，例如木質磺酸

鹽；順丁烯二酸或琥珀酸或其酐；烯烴磺酸鹽；磷酸酯如酯烷氧化物之磷酸酯、烷基苯酚之磷酸酯與苯乙烯基苯酚乙氧化物之磷酸酯；蛋白質基表面活性劑；肌胺酸衍生物；苯乙烯酚醚硫酸酯；油及脂肪酸之硫酸酯與磺酸酯；乙氧基化烷基苯酚之硫酸酯與磺酸酯；醇之硫酸酯；乙氧基化醇之硫酸酯；胺與醯胺的磺酸酯，如 *N,N*-烷牛磺酸酯；苯、異丙苯、甲苯、萘與十二烷基苯及十三烷基苯之磺酸酯；縮合萘的磺酸酯；萘與烷基萘的磺酸酯；分餾石油的磺酸酯；磺琥珀醯胺酸鹽；以及磺琥珀酸鹽以及其衍生物如二烷基磺基琥珀酸鹽。

有用之陽離子表面活性劑包括但不限於：醯胺以及乙氧基化醯胺；胺如 *N*-烷基丙二胺、三丙烯三胺及二丙烯四，以及乙氧基化胺、乙氧基化二胺和丙氧基化胺（由胺及環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物所製備者）；胺鹽，例如乙酸胺以及二胺鹽類；四級銨鹽如四級鹽、乙氧基化四級鹽以及雙四級鹽；以及胺氧化物，例如烷二甲胺氧化物以及雙-(2-羥乙基)-烷基胺氧化物。

亦可用於本發明組成物者為非離子表面活性劑與陰離子表面活性劑的混合物，或是非離子表面活性劑與陽離子表面活性劑的混合物。非離子、陰離子及陽離子表面活性劑及其建議用法係揭露於各式公開參考文獻，包括 *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*，年度美國及國際版，*McCutcheon's Division* 出版，*The Manufacturing Confectioner Publishing Co.*；*Sisely* 與 *Wood*，*Encyclopedia of Surface Active Agents*，*Chemical*

Publ. Co., Inc., New York, 1964; 以及 A S. Davidson 與 B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, 第 7 版, John Wiley and Sons, New York, 1987。

本發明組成物亦可包含製劑輔助劑及添加劑, 及熟悉該項技術領域者熟知之製劑助劑(其中部分亦可視為提供固體稀釋劑、液體稀釋劑或表面活性劑之功能)。這些配方輔助劑以及添加劑可控制: pH(緩衝溶液)、處理期間的發泡(抗發泡劑如聚有機矽氧烷)、活性成份的沉積(懸浮劑)、黏滯性(觸變增稠劑)、容器中之微生物生長(抗菌劑)、產物凍結(抗凍劑)、顏色(染料/顏料分散液)、洗除(成膜劑或黏著劑)、蒸發(蒸發阻滯劑)以及其他製劑特性。成膜劑包括例如聚乙酸乙烯、聚乙酸乙烯共聚物、聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯共聚物、聚乙烯醇、聚乙烯醇共聚物及蠟。製劑輔助劑及添加劑之實例包括列示於以下文獻者: *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, 年度國際及北美版, McCutcheon's Division 出版, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; 以及 PCT 公開第 WO 03/024222 號。

式 1 化合物以及任何其他活性成分, 典型為藉由在溶劑中溶解活性成分或在一液體或乾性稀釋劑中磨碎, 而結合至本發明組成物中。藉由簡單混合成分可製備出液劑, 包括可乳化濃縮物。若打算用作為可乳化濃縮物之液體組成物的溶劑與水不互溶, 則通常會在用水稀釋時, 加入乳化劑以乳化該含活性成分之溶劑。粒徑高達 2,000 μm 的活性成分漿液可使用介質研磨機濕磨, 以獲得平均直徑在 3 μm 以下的粒子。水性漿液可

製成為成品懸浮濃縮物(請參見如 U.S. 3,060,084)或藉由噴霧乾燥進一步加工成水分散性粒劑。乾式配方通常需要乾磨製程,其產生的平均粒徑在 2 到 10 μm 的範圍內。塵粉及粉劑可藉由摻合以及通常加上研磨(如以錘磨或液能研磨機)而製備。粒劑及丸劑係透過將活性材料噴灑於預成形之粒狀載體或以黏聚技術製成。請參見 Browning,「Agglomeration」, *Chemical Engineering*, 1967 年 12 月 4 日,第 147-48 頁, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 第 4 版, McGraw-Hill, New York, 1963, 第 8-57 頁及以下,以及 WO 91/13546。丸劑的製備如在 U.S. 4,172,714 中所述。水分散性和水溶性顆粒的製備如在 U.S. 4,144,050、U.S. 3,920,442 及 DE 3,246,493 中所教示。片劑的製備如在 U.S. 5,180,587、U.S. 5,232,701 及 U.S. 5,208,030 中所教示。膜的製備如在 GB 2,095,558 及 U.S. 3,299,566 中所教示。

有關製劑技術之進一步資訊,請參見 T. S. Woods, 「The Formulator's Toolbox – Product Forms for Modern Agriculture」於 *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T. Brooks 與 T. R. Roberts 編輯, Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, 第 120 至 133 頁。亦請參見美國專利第 3,235,361 號第 6 欄 16 行到第 7 欄 19 行及實例 10-41; 美國專利第 3,309,192 號第 5 欄 43 行到第 7 欄 62 行及實例 8、12、15、39、41、52、53、58、132、138-140、162-164、166、167 及 169-182; 美國專利第

2,891,855 號第 3 欄 66 行到第 5 欄 17 行及實例 1 - 4 ;
Klingman , *Weed Control as a Science* , John Wiley and
Sons, Inc. , New York , 1961 , 第 81 至 96 頁 ; Hance
等人 , *Weed Control Handbook* , 第 8 版 , Blackwell
Scientific Publications , Oxford , 1989 ; 以 及
Developments in formulation technology , PJB
Publications , Richmond , UK , 2000 。

在下面的實例中，所有的百分比均為按重量計且所
有的製劑均以常規方式製備。化合物編號則參照索引表
A 中的化合物。即使沒有進一步的闡述，相信使用上述
說明的本領域具有通常知識者仍能夠最大程度地利用
本發明。因此，以下實例僅為說明之用，而絕非用於限
制本發明之揭露內容。除非另有說明，百分比為按重量
計。

實例 A

高強度濃縮物	
化合物 47	49.3%
吡嗪菌胺	49.2%
二氧化矽氣凝膠	0.5%
合成非晶質細二氧化矽	1.0%

實例 B

可濕性粉末	
化合物 81	43.0%
快諾芬	22.0%
十二烷基酚聚乙二醇醚	2.0%
木質磺酸鈉	4.0%
矽鋁酸鈉	6.0%
蒙脫土(經煅燒)	23.0%

實例 C

粒劑

化合物 136	7.5%
依普座	2.5%
厄帖浦石粒劑(低揮發性物質， 0.71/0.30 mm；U.S. S.第 25-50 號篩)	90.0%

實例 D

擠製顆粒

化合物 144	8.0%
萁孢菌素	17.0%
無水硫酸鈉	10.0%
粗木質磺酸鈣	5.0%
烷基萘磺酸鈉	1.0%
鈣/鎂膨土	59.0%

實例 E

可乳化濃縮物

化合物 161	5.0%
亞托敏	5.0%
聚氧乙烯山梨糖醇己油酸(polyoxyethylene sorbitol hexoleate)	20.0%
C ₆ -C ₁₀ 脂肪酸甲酯	70.0%

實例 F

微乳液

化合物 195	3.3%
啞氧菌酯	1.7%
聚乙烯吡咯啉酮-乙酸乙烯酯共聚物	30.0%
烷基聚葡萄糖苷(alkylpolyglycoside)	30.0%
甘油單油酸酯(glyceryl monooleate)	15.0%
水	20.0%

實例 G

種子處理

化合物 238	4.00%
依普同	16.00%
聚乙烯吡咯啉酮-乙酸乙烯酯共聚物	5.00%
褐煤酸蠟	5.00%
木質磺酸鈣	1.00%
聚氧乙烯/聚氧丙烯嵌段共聚物	1.00%
硬脂醇(POE 20)	2.00%
聚有機矽烷(polyorganosilane)	0.20%
紅色色素	0.05%
水	65.75%

實例 H

可乳化濃縮物

化合物 239	10.0%
聚氧乙烯山梨糖醇己油酸(polyoxyethylene sorbitol hexoleate)	20.0%
C ₆ -C ₁₀ 脂肪酸甲酯	70.0%

在施用前，通常會以水稀釋製劑(如製劑表中者)以形成水性組成物。用以直接施用於植物或其部分組織(例如噴灑桶組成物)的水性組成物典型包括至少約 1

ppm 或更多(例如 1 ppm 至 100 ppm)之根據本發明的殺真菌活性化合物。

組分(b)殺真菌化合物之實例包括阿拉酸式苯-S-甲基、愛地福、辛唑啉菌胺、安美速、敵菌靈、阿扎康唑、亞托敏、本達樂、右本達樂、麥鏽靈、免賴得、苯噻菌胺、苯噻菌胺-異丙基、比托沙、百蟎克、聯苯、比多農、必殺芬、保米黴素、白克列、溴克座、布瑞莫、得滅多、萎鏽靈、加普胺、四氯丹、蓋普丹、貝芬替、二氯甲氧苯、四氯異苯腈、克氯得、克霉唑、銅鹽如波多混合物(三元硫酸銅)、氫氧化銅與氯氧化銅、賽座滅、賽芬胺、克絕、環克座、賽普洛、益發靈、雙氯氰菌胺、達滅淨、大克爛、乙霉威、待克利、二氟林、二甲依瑞莫、達滅芬、醚菌胺、達克利、達克利-M、白粉克、腈硫醯、十二環嗎啉、多寧、護粒松、烯肟菌酯、依普座、乙環唑、噻唑菌胺、依瑞、依得利(tridiazole)、凡殺同、咪唑菌酮、芬瑞莫、芬克座、甲呋醯胺、環醯菌胺、芬諾尼、拌種咯、苯鏽啖、芬普福、胺苯吡菌酮、三苯醋錫、三苯氯、三苯羥錫、富爾邦、富米綜、扶吉胺、護汰寧、氟醯菌胺、氟嗎啉、氟比來(亦已知為批苯殺)、氟吡菌醯胺、氟里醚(fluoroimide)、氟啉菌酯、氟喹唑、護砂得、氟硫滅、福多寧(flutianil)(2-[[2-氯-5-(三氯甲基)苯基]硫基]-2-[3-(2-甲氧苯基)-2-亞四氫噻唑基]乙腈)、福多寧、護汰芬、福熱殺(fluxapyroxad)、福爾培、福賽得、麥穗寧、呋霜靈、福拉比、菲克利、殺紋寧(hymexazol)、克熱淨、依滅列、易胺座、克熱淨、愛得寶、種菌唑、丙基喜樂松、依普同、丙森鋅、亞賜圃、

異吡聯(isopyrazam)、異噻菌胺、嘉賜黴素、克收欣、鋅錳乃浦、曼普胺、錳乃浦、滅普寧、氧乙酸基白粉克、滅達樂、滅達樂-M、滅特座、滅速克、免得爛、苯氧菌胺、滅派林、滅芬農、邁克尼、納芙迪芬(naftifine)、新阿蘇仁(鐵甲砷酸銨)、尼瑞莫、辛噻酮、呋醯胺、肱醚菌胺、毆殺斯、歐索林酸、惡咪唑、嘉保信、氧四環素、平克座、賓克隆、派福芬、吡噻菌胺、披扶座、亞磷酸及其鹽、熱必斯、啖氧菌酯、粉病靈、多氧菌素、撲殺熱、撲克拉、撲滅寧、普拔克、普拔克-鹽酸鹽、普克利、甲基鋅乃浦、丙氧喹啉、丙硫菌唑、百克敏、唑胺菌酯、唑菌酯、白粉松、防霉丹、稗草畏、比芬諾、派美尼、派芬農、百快隆、吡咯菌素、奎因克座、滅蟪蛄、快諾芬、五氯硝苯、環丙吡菌胺、矽噻菌胺、矽氟唑、萁孢菌素、鏈黴素、硫、得克利、泰伏勤、克枯爛、四氯硝基苯、特比萘酚(terbinafine)、四克利、腐絕、賽氟滅、多保淨、甲基多保淨、得恩地、噻醯菌胺、脫克松、甲基益發靈、三泰芬、三泰隆、噻菌醇、咪唑嗪、三賽唑、三得芬、賽福座、三賽唑、三氟敏、賽福寧、三芬醯胺三賽唑、滅菌唑、單克素、維利黴素、瓦芬耐(valiphenal)、免克寧、鋅乃浦、福美鋅、座賽胺、*N'*-[4-[4-氯-3-(三氟甲基)苯氧基]-2,5-二甲苯基]-*N*-乙基-*N*-甲基甲醯亞胺醯胺、5-氯-6-(2,4,6-三氟苯基)-7-(4-甲哌啶-1-基)[1,2,4]三唑并[1,5-*a*]嘧啶(BAS600)、*N*-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧基]-3-甲氧苯基]乙基]-3-甲基-2-[(甲磺醯基)胺基]丁醯胺、*N*-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧基]-3-甲氧苯基]乙基]-3-甲基-2-[(乙磺醯

基)胺基]丁醯胺、2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4*H*-1-苯并哌喃-4-酮、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基-3-異噁唑啉基]吡啶、*N*-[1-[[[1-(4-氯苯基)乙基]磺醯基]甲基]丙基]胺基甲酸 4-氯苯酯、*N*-[(環丙甲氧基)胺基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]亞甲基]苯乙醯胺、 α -(甲氧亞胺基)-*N*-甲基-2-[[[1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基]亞胺基]甲基]苯乙醯胺、*N'*-[4-[4-氯-3-(三氟甲基)苯氧基]-2,5-二甲苯基]-*N*-乙基-*N*-甲基甲醯亞胺醯胺、*N*-(4-氯-2-硝苯基)-*N*-乙基-4-甲苯磺醯胺、2-[[[3-(2,6-二氯苯基)-1-甲基-2-丙烯-1-亞基]胺基]氧基]甲基]- α -(甲氧亞胺基)-*N*-甲苯乙醯胺、1-[(2-丙烯硫基)羰基]-2-(1-甲基乙基)-4-(2-甲苯基)-5-胺-1*H*-吡唑-3-酮、乙基-6-辛基-[1,2,4]三唑并[1,5-*a*]嘧啶-7-基胺、*N*-[4-[[[(1-甲基-1*H*-四唑-5-基)苯亞甲基]胺基]氧基]甲基]-2-噻唑基]胺基甲酸戊酯、*N*-[6-[[[(1-甲基-1*H*-四唑-5-基)苯亞甲基]胺基]氧基]甲基]-2-吡啶基]胺基甲酸戊酯、2-[(3-溴-6-喹啉基)氧基]-*N*-(1,1-二甲基-2-丁炔-1-基)-2-(甲硫基)乙醯胺、2-[(3-乙炔基-6-喹啉基)氧基]-*N*-[1-(羥甲基)-1-甲基-2-丙炔-1-基]-2-(甲硫基)乙醯胺、*N*-(1,1-二甲基-2-丁炔-1-基)-2-[(3-乙炔基-6-喹啉基)氧基]-2-(甲硫基)乙醯胺與 *N'*-[4-[3-[(4-氯苯基)甲基]-1,2,4-噻二唑-5-基]氧基]-2,5-二甲苯基]-*N*-乙基-*N*-甲基甲醯亞胺醯胺。值得注意的是先前列示者中亦排除 *N'*-[4-[3-[(4-氯苯基)甲基]-1,2,4-噻二唑-5-基]氧基]-2,5-二甲苯基]-*N*-乙基-*N*-甲基甲醯亞胺醯胺。值得進一步注意的是先前列示者中亦排除得滅多、乙環唑、奎因克座、嘧菌醇、2-[(3-溴

-6-喹啉基)氧基]-*N*-(1,1-二甲基-2-丁炔-1-基)-2-(甲硫基)乙醯胺、2-[(3-乙炔基-6-喹啉基)氧基]-*N*-[1-(羥甲基)-1-甲基-2-丙炔-1-基]-2-(甲硫基)乙醯胺與 *N*-(1,1-二甲基-2-丁炔-1-基)-2-[(3-乙炔基-6-喹啉基)氧基]-2-(甲硫基)乙醯胺。

在本發明組成物之組分(b)中，值得注意的殺真菌化合物為亞托敏、克收欣、三氟敏、百克敏、唑胺菌酯、唑菌酯、啉氧菌酯、醚菌胺、苯氧菌胺、貝芬替、四氯異苯腈、快諾芬、滅芬農、派芬農、賽芬胺、苯鏽啉、芬普福、溴克座、環克座、待克利、依普座、乙環唑、芬克座、護矽得、福熱殺(fluxapyroxad)、菲克利、種菌唑、滅特座、邁克尼、平克座、普克利、丙氧喹啉、丙硫菌唑、得克利、滅菌唑、凡殺同、撲克拉、吡噻菌胺與白克列(nicobifen)。

用於更有效防治由真菌類植物病原體造成之植物病害(例如較低使用率或較廣之植物病原體防治範圍)或抗性管理的一般較佳者為，一式 1 化合物、一其 *N*-氧化物或其鹽與一選自由以下所組成之群組的殺真菌化合物之混合物：亞托敏、克收欣、三氟敏、百克敏、唑胺菌酯、唑菌酯、啉氧菌酯、醚菌胺、苯氧菌胺、快諾芬、滅芬農、賽芬胺、苯鏽啉、芬普福、環克座、待克利、依普座、乙環唑、護矽得、滅特座、邁克尼、普克利、丙氧喹啉、丙硫菌唑、派芬農、得克利、滅菌唑、凡殺同與吡噻菌胺。

在本發明的殺真菌組成合物中，組分(a)(即至少一種選自式 1 化合物、其 *N*-氧化物及其鹽)與組分(b)係以

殺真菌有效量存在。組分(b)(即一或多種額外之殺真菌化合物)對組分(a)之重量比例通常介於約 1:3000 與約 3000:1 間，而更典型為介於約 1:500 與約 500:1 間。表 B1 列出關於組分(b)之特定殺真菌化合物的典型、更典型以及最典型的比例範圍。表 A1 至 A43 與 C1 至 C43 例示殺真菌化合物之特定組合物的重量比例。值得注意的組成物為組分(a)對組分(b)之重量比例為約 125:1 至約 1:125 者。在具有組分(b)之許多殺真菌化合物下，這些組成物對於防治真菌類植物病原體所造成的植物病害具有特別良好的效果。值得進一步注意的組成物為組分(a)對組分(b)之重量比例為約 25:1 至約 1:25 者，或約 5:1 至約 1:5 者。熟習該項技術者可藉由簡單實驗來迅速決定重量比例，以及對於欲達成之殺真菌保護以及防治範圍所必須的殺真菌化合物之施用率。顯然地，相較於單獨使用組分(a)所能防治的範圍，將額外殺真菌化合物包括在組分(b)中可能擴大對於植物病害的防治範圍。

特定混合物(化合物編號參照索引表 A 中的化合物)列於表 A1 至 A43。在表 A1 中，在欄位標題「組分(a)」以及「組分(b)」下之各行特定揭露一種組分(a)(其為化合物 3)與組分(b)殺真菌化合物之混合物。標題「說明性比例」下的項目揭露在該揭露混合物中，組分(b)對組分(a)的三種特定重量百分比。例如，表 A1 第一行揭露化合物 3 與阿拉酸式苯-S-甲基之混合物，並且列出阿拉酸式苯-S-甲基對化合物 3 之重量比例為 1:1、1:4 或 1:18。

表 A1

組分(a)	組分(b)	說明性比例(*)		
化合物 3	阿拉酸式苯-S-甲基	1:1	1:4	1:18
化合物 3	愛地福	7:1	3:1	1:1
化合物 3	辛唑啉菌胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	安美速	1:1	1:2	1:6
化合物 3	敵菌靈	22:1	8:1	4:1
化合物 3	阿扎康唑	2:1	1:2	1:4
化合物 3	亞托敏	3:1	1:1	1:3
化合物 3	本達樂	1:1	1:2	1:6
化合物 3	右本達樂	1:1	1:3	1:8
化合物 3	麥鏽靈	4:1	2:1	1:2
化合物 3	免賴得	11:1	4:1	1:1
化合物 3	苯噻菌胺	1:1	1:4	1:12
化合物 3	苯噻菌胺-異丙基	1:1	1:4	1:12
化合物 3	比托沙	15:1	5:1	2:1
化合物 3	百蟊克	15:1	5:1	2:1
化合物 3	聯苯	15:1	5:1	2:1
化合物 3	比多農	3:1	1:1	1:2
化合物 3	必殺芬	2:1	1:1	1:3
化合物 3	保米黴素	1:4	1:12	1:30
化合物 3	波多混合液(三元硫酸銅)	45:1	15:1	5:1
化合物 3	白克列	4:1	2:1	1:2
化合物 3	溴克座	3:1	1:1	1:3
化合物 3	布瑞莫	1:3	1:10	1:30
化合物 3	四氯丹	15:1	5:1	2:1
化合物 3	蓋普丹	15:1	5:1	2:1
化合物 3	貝芬替	11:1	4:1	2:1
化合物 3	萎鏽靈	4:1	2:1	1:2
化合物 3	加普胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	二氯甲氧苯	100:1	35:1	14:1
化合物 3	四氯異苯腈	15:1	5:1	2:1
化合物 3	克氣得	11:1	4:1	2:1
化合物 3	克黴唑	3:1	1:1	1:3

104 年 6 月 8 日修正替換頁

組分(a)	組分(b)	說明性比例(*)		
化合物 3	氫氧化銅	45:1	15:1	5:1
化合物 3	氯氧化銅	45:1	15:1	5:1
化合物 3	賽座滅	1:1	1:2	1:6
化合物 3	賽芬胺	1:2	1:6	1:24
化合物 3	克絕	1:1	1:2	1:5
化合物 3	環克座	1:1	1:2	1:6
化合物 3	賽普洛	4:1	2:1	1:2
化合物 3	益發靈	15:1	5:1	2:1
化合物 3	雙氯氯菌胺	15:1	5:1	2:1
化合物 3	達滅淨	3:1	1:1	1:3
化合物 3	大克爛	15:1	5:1	2:1
化合物 3	乙霉威	7:1	2:1	1:2
化合物 3	待克利	1:1	1:3	1:12
化合物 3	二氟林	15:1	5:1	2:1
化合物 3	二甲依瑞莫	1:3	1:8	1:30
化合物 3	達滅芬	3:1	1:1	1:2
化合物 3	醚菌胺	2:1	1:1	1:4
化合物 3	達克利	1:1	1:3	1:8
化合物 3	達克利-M	1:1	1:3	1:12
化合物 3	白粉克	2:1	1:1	1:3
化合物 3	腈硫醌	5:1	2:1	1:2
化合物 3	十二環嗎啉	7:1	3:1	1:1
化合物 3	多寧	10:1	4:1	2:1
化合物 3	護粒松	3:1	1:1	1:3
化合物 3	烯肟菌酯	2:1	1:1	1:4
化合物 3	依普座	1:1	1:3	1:7
化合物 3	乙環唑	1:1	1:3	1:7
化合物 3	噻唑菌胺	2:1	1:1	1:3
化合物 3	依瑞莫	7:1	3:1	1:1
化合物 3	依得利	7:1	2:1	1:2
化合物 3	凡殺同	2:1	1:1	1:4
化合物 3	咪唑菌酮	2:1	1:1	1:4
化合物 3	芬瑞莫	1:2	1:7	1:24
化合物 3	芬克座	1:1	1:3	1:10
化合物 3	甲呋醯胺	4:1	1:1	1:2

104 年 6 月 8 日修正替換頁

組分(a)	組分(b)	說明性比例(*)		
化合物 3	環醯菌胺	10:1	4:1	2:1
化合物 3	芬諾尼	15:1	4:1	1:1
化合物 3	拌種咯	15:1	5:1	2:1
化合物 3	苯鏽啉	7:1	2:1	1:1
化合物 3	芬普福	7:1	2:1	1:1
化合物 3	胺苯吡菌酮	3:1	1:1	1:3
化合物 3	三苯錫鹽如三苯醋錫、三苯氣錫或三苯羥錫	3:1	1:1	1:3
化合物 3	富爾邦	30:1	10:1	4:1
化合物 3	富米綜	7:1	2:1	1:2
化合物 3	扶吉胺	3:1	1:1	1:2
化合物 3	護汰寧	2:1	1:1	1:4
化合物 3	氟醯菌胺	3:1	1:1	1:2
化合物 3	氟嗎啉	3:1	1:1	1:3
化合物 3	氟比來	1:1	1:2	1:6
化合物 3	氟吡菌醯胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	氟里醚	37:1	14:1	5:1
化合物 3	氟密菌酯	1:1	1:2	1:6
化合物 3	氟喹唑	1:1	1:2	1:4
化合物 3	護矽得	3:1	1:1	1:3
化合物 3	氟硫滅	15:1	5:1	2:1
化合物 3	氟噻菌淨	1:1	1:2	1:6
化合物 3	福多寧	4:1	1:1	1:2
化合物 3	護汰芬	1:1	1:2	1:4
化合物 3	福熱殺(fluxapyroxad)	2:1	1:1	1:3
化合物 3	福爾培	15:1	5:1	2:1
化合物 3	福賽得	30:1	12:1	5:1
化合物 3	麥穗寧	11:1	4:1	2:1
化合物 3	呋霜靈	1:1	1:2	1:6
化合物 3	福拉比	15:1	5:1	2:1
化合物 3	克熱淨	15:1	5:1	2:1
化合物 3	菲克利	1:1	1:2	1:5
化合物 3	殺紋寧	75:1	25:1	9:1
化合物 3	依滅列	1:1	1:2	1:5
化合物 3	易胺座	1:1	1:2	1:5
化合物 3	克熱淨	15:1	4:1	1:1

104 年 6 月 8 日修正替換頁

組分(a)	組分(b)	說明性比例(*)		
化合物 3	愛得寶	15:1	5:1	2:1
化合物 3	種菌唑	1:1	1:2	1:5
化合物 3	丙基喜樂松	15:1	5:1	2:1
化合物 3	依普同	15:1	5:1	2:1
化合物 3	丙森鋅	2:1	1:1	1:3
化合物 3	亞賜圃	45:1	15:1	5:1
化合物 3	異吡聯(isopyrazam)	2:1	1:1	1:3
化合物 3	異噻菌胺	2:1	1:1	1:3
化合物 3	嘉賜黴素	1:2	1:7	1:24
化合物 3	克收欣	2:1	1:1	1:4
化合物 3	鋅錳乃浦	22:1	7:1	3:1
化合物 3	曼普胺	2:1	1:1	1:4
化合物 3	錳乃浦	22:1	7:1	3:1
化合物 3	滅派林	6:1	2:1	1:1
化合物 3	滅普寧	1:1	1:2	1:6
化合物 3	氧乙酸基白粉克	2:1	1:1	1:3
化合物 3	滅達樂	1:1	1:2	1:6
化合物 3	滅達樂-M	1:1	1:4	1:12
化合物 3	滅特座	1:1	1:2	1:6
化合物 3	滅速克	15:1	5:1	2:1
化合物 3	免得爛	15:1	5:1	2:1
化合物 3	苯氧菌胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	滅芬農	2:1	1:1	1:4
化合物 3	邁克尼	1:1	1:3	1:8
化合物 3	納芙迪芬	15:1	5:1	2:1
化合物 3	新阿蘇仁(鐵甲砷酸銨)	15:1	5:1	2:1
化合物 3	尼瑞莫	3:1	1:1	1:3
化合物 3	辛噻酮	15:1	4:1	1:1
化合物 3	呋醯胺	1:1	1:2	1:6
化合物 3	肱醚菌胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	毆殺斯	1:1	1:2	1:6
化合物 3	歐索林酸	7:1	2:1	1:2
化合物 3	惡咪唑	1:1	1:2	1:5
化合物 3	嘉保信	4:1	1:1	1:2
化合物 3	氧四環素	3:1	1:1	1:3

104 年 6 月 8 日修正替換頁

組分(a)	組分(b)	說明性比例(*)		
		15:1	5:1	2:1
化合物 3	披扶座	15:1	5:1	2:1
化合物 3	平克座	1:2	1:6	1:15
化合物 3	賓克隆	11:1	4:1	2:1
化合物 3	派福芬	2:1	1:1	1:3
化合物 3	吡噻菌胺	2:1	1:1	1:3
化合物 3	亞磷酸或其鹽	15:1	6:1	2:1
化合物 3	熱必斯	15:1	6:1	2:1
化合物 3	啉氧菌酯	1:1	1:2	1:5
化合物 3	粉病靈	3:1	1:1	1:3
化合物 3	多氧菌素	3:1	1:1	1:3
化合物 3	撲殺熱	3:1	1:1	1:3
化合物 3	撲克拉	7:1	2:1	1:2
化合物 3	撲滅寧	11:1	4:1	2:1
化合物 3	普拔克或普拔克鹽酸鹽	10:1	4:1	2:1
化合物 3	普克利	1:1	1:2	1:5
化合物 3	甲基鋅乃浦	11:1	4:1	2:1
化合物 3	丙氧喹啉	1:1	1:3	1:12
化合物 3	胺丙威	3:1	1:1	1:3
化合物 3	丙硫菌唑	1:1	1:2	1:5
化合物 3	百克敏	2:1	1:1	1:4
化合物 3	唑胺菌酯	2:1	1:1	1:4
化合物 3	唑菌酯	2:1	1:1	1:4
化合物 3	白粉松	15:1	4:1	1:1
化合物 3	防霉丹	4:1	1:1	1:2
化合物 3	稗草畏	15:1	4:1	1:1
化合物 3	比芬諾	3:1	1:1	1:3
化合物 3	派美尼	3:1	1:1	1:2
化合物 3	派芬農	2:1	1:1	1:4
化合物 3	百快隆	3:1	1:1	1:3
化合物 3	吡咯菌素	15:1	5:1	2:1
化合物 3	奎因克座	1:1	1:2	1:4
化合物 3	滅蟎猛	15:1	5:1	2:1
化合物 3	快諾芬	1:1	1:2	1:6
化合物 3	五氯硝苯	15:1	5:1	2:1
化合物 3	矽噻菌胺	2:1	1:1	1:4

104 年 6 月 8 日修正替換頁

組分(a)	組分(b)	說明性比例(*)		
化合物 3	矽氟唑	1:1	1:2	1:5
化合物 3	萁孢菌素	5:1	2:1	1:2
化合物 3	鏈黴素	3:1	1:1	1:3
化合物 3	硫	75:1	25:1	9:1
化合物 3	得克利	1:1	1:2	1:5
化合物 3	泰伏勤	3:1	1:1	1:3
化合物 3	克枯爛	15:1	5:1	2:1
化合物 3	四氯硝基苯	15:1	5:1	2:1
化合物 3	特比萘酚	15:1	5:1	2:1
化合物 3	四克利	1:1	1:2	1:5
化合物 3	腐絕	11:1	4:1	2:1
化合物 3	賽氟滅	3:1	1:1	1:3
化合物 3	多保淨	11:1	4:1	2:1
化合物 3	甲基多保淨	11:1	4:1	2:1
化合物 3	得恩地	37:1	14:1	5:1
化合物 3	噻醯菌胺	2:1	1:1	1:3
化合物 3	脫克松	37:1	14:1	5:1
化合物 3	甲基益發靈	15:1	5:1	2:1
化合物 3	三泰芬	1:1	1:2	1:5
化合物 3	三泰隆	1:1	1:2	1:5
化合物 3	噻菌醇	1:2	1:7	1:24
化合物 3	咪唑嗪	15:1	5:1	2:1
化合物 3	三賽唑	3:1	1:1	1:3
化合物 3	三得芬	7:1	2:1	1:1
化合物 3	三氟敏	2:1	1:1	1:4
化合物 3	賽福座	3:1	1:1	1:3
化合物 3	賽福寧	3:1	1:1	1:3
化合物 3	三芬醯胺	7:1	2:1	1:2
化合物 3	滅菌唑	1:1	1:2	1:5
化合物 3	單克素	1:1	1:2	1:5
化合物 3	維利黴素	3:1	1:1	1:3
化合物 3	瓦芬耐	2:1	1:1	1:4
化合物 3	免克寧	15:1	6:1	2:1
化合物 3	鋅乃浦	37:1	14:1	5:1
化合物 3	福美鋅	37:1	14:1	5:1

104 年 6 月 8 日修正替換頁

組分(a)	組分(b)	說明性比例(*)		
化合物 3	座賽胺	2:1	1:1	1:4
化合物 3	5-氯-6-(2,4,6-三氯苯基)-7-(4-甲哌啶-1-基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶	1:1	1:2	1:6
化合物 3	<i>N</i> -[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧基]-3-甲氧苯基]乙基]-3-甲基-2-[(甲磺基)胺基]丁醯胺	2:1	1:1	1:4
化合物 3	<i>N</i> -[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧基]-3-甲氧苯基]乙基]-3-甲基-2-[(乙磺基)胺基]丁醯胺	2:1	1:1	1:4
化合物 3	2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4 <i>H</i> -1-苯并哌喃-4-酮	1:1	1:3	1:12
化合物 3	3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基-3-異噁唑啉基]吡啶	3:1	1:1	1:3
化合物 3	<i>N'</i> -[4-[[3-[(4-氯苯基)甲基]-1,2,4-噻二唑-5-基]氧基]-2,5-二甲苯基]- <i>N</i> -乙基- <i>N</i> -甲基甲醯亞胺醯胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	<i>N</i> -[1-[[[1-(4-氯苯基)乙基]磺基]甲基]丙基]胺基甲酸 4-氯苯酯	2:1	1:1	1:4
化合物 3	<i>N</i> -[[環丙甲氧基]胺基][6-(二氯甲氧基)-2,3-二氯苯基]亞甲基]苯乙醯胺	1:2	1:7	1:24
化合物 3	α -[甲氧亞胺基]- <i>N</i> -甲基-2-[[[1-[3-(三氯甲基)苯基]乙氧基]亞胺基]甲基]苯乙醯胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	<i>N'</i> -[4-[4-氯-3-(三氯甲基)苯氧基]-2,5-二甲苯基]- <i>N</i> -乙基- <i>N</i> -甲基甲醯亞胺醯胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	<i>N</i> -(4-氯-2-硝基)- <i>N</i> -乙基-4-甲磺基醯胺	3:1	1:1	1:3
化合物 3	2-[[[3-(2,6-二氯苯基)-1-甲基-2-丙烯-1-亞基]胺基]氧基]甲基]- α -(甲氧亞胺基)- <i>N</i> -甲	3:1	1:1	1:3
化合物 3	苯乙醯胺			
化合物 3	<i>N</i> -[4-[[[(1-甲基-1 <i>H</i> -四唑-5-基)苯亞甲基]胺基]氧基]甲基]-2-噻唑基]胺基甲酸戊酯	3:1	1:1	1:3
化合物 3	<i>N</i> -[6-[[[(1-甲基-1 <i>H</i> -四唑-5-基)苯亞甲基]胺基]氧基]甲基]-2-吡啶基]胺基甲酸戊酯	3:1	1:1	1:3
化合物 3	2-[(3-溴-6-喹啉基)氧基]- <i>N</i> -(1,1-二甲基-2-丁炔-1-基)-2-(甲硫基)乙醯胺	2:1	1:1	1:4
化合物 3	2-[(3-乙炔基-6-喹啉基)氧基]- <i>N</i> -[1-(羥基)-1-甲基-2-丙炔-1-基]-2-(甲硫基)乙醯胺	2:1	1:1	1:4
化合物 3	<i>N</i> -(1,1-二甲基-2-丁炔-1-基)-2-[(3-乙炔基-6-喹啉基)氧基]-2-(甲硫基)乙醯胺	2:1	1:1	1:4

(*) 組分(b)相對於組分(a)之重量比例。

表 A2 至 A43 除了「組分(a)」欄位標題係以下示之各別組分(a)欄位項目代替之外，各與上述表 A1 架構相同。因此，例如在表 A2 中，「組分(a)」欄位標題下之項目均標示為「化合物 7」，且表 A2 中欄位標題下之第一行特定揭露一種化合物 7 與阿拉酸式苯-S-甲基之混合物。表 A3 至 A43 係類似架構。

表格編號	組分(a)欄位項目	表格編號	組分(a)欄位項目
A2	化合物 7	A23	化合物 252
A3	化合物 8	A24	化合物 253
A4	化合物 13	A25	化合物 254
A5	化合物 17	A26	化合物 257
A6	化合物 40	A27	化合物 258
A7	化合物 47	A28	化合物 259
A8	化合物 81	A29	化合物 260
A9	化合物 82	A30	化合物 261
A10	化合物 122	A31	化合物 262
A11	化合物 136	A32	化合物 263
A12	化合物 143	A33	化合物 264
A13	化合物 144	A34	化合物 265
A14	化合物 161	A35	化合物 266
A15	化合物 195	A36	化合物 267
A16	化合物 238	A37	化合物 268
A17	化合物 239	A38	化合物 269
A18	化合物 240	A39	化合物 270
A19	化合物 241	A40	化合物 271
A20	化合物 244	A41	化合物 273
A21	化合物 245	A42	化合物 275
A22	化合物 247	A43	化合物 276

表 B1 列出說明本發明混合物、組成物及方法之組分(b)化合物與組分(a)的特定組合物。表 B1 的第一欄列出特定組分(b)化合物(例如第一行的「阿拉酸式苯-S-甲基」)。表 B1 的第二、第三與第四欄列出重量比例範圍，其為組分(b)化合物相對於組分(a)於田間生長作物之典型施用率(例如「2:1 至 1:180」為阿拉酸式苯-S-甲基相對於組分(a)，以重量計))。因此，例如表 B1 的第一行特定揭露阿拉酸式苯-S-甲基與組分(a)典型為以介於 2:1 至 1:180 間之重量比例施用。表 B1 其餘行的架構則及其類似。值得注意的是一種以列於實施例 45 中的任一化合物作為組分(a)與列於表 B1 之組分(b)欄位的化合物之混合物，其根據表 B1 揭露之重量比例混合。因此對於在表 A1 至 A43 中所揭露之特定比例，表 B1 提供針對這些組合物的比例範圍來補充。

表 B1

組分(b)	典型 重量比	更典型 重量比	最典型 重量比
阿拉酸式苯-S-甲基	2:1 對 1:180	1:1 對 1:60	1:1 對 1:18
愛地福	30:1 對 1:3	10:1 對 1:1	7:1 對 1:1
辛唑啉菌胺	9:1 對 1:18	3:1 對 1:6	3:1 對 1:3
安美速	6:1 對 1:18	2:1 對 1:6	1:1 對 1:6
敵菌靈	90:1 對 2:1	30:1 對 4:1	22:1 對 4:1
阿扎康唑	7:1 對 1:18	2:1 對 1:6	2:1 對 1:4
亞托敏	9:1 對 1:12	3:1 對 1:4	3:1 對 1:3
本達樂	4:1 對 1:18	1:1 對 1:6	1:1 對 1:6
右本達樂	4:1 對 1:36	1:1 對 1:12	1:1 對 1:8
麥鏽靈	18:1 對 1:6	6:1 對 1:2	4:1 對 1:2
免賴得	45:1 對 1:4	15:1 對 1:1	11:1 對 1:1
苯噻菌胺或苯噻菌胺-異丙基	2:1 對 1:36	1:1 對 1:12	1:1 對 1:12

104 年 6 月 8 日修正替換頁

組分(b)	典型 重量比	更典型 重量比	最典型 重量比
比托沙	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
百端克	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
聯苯	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
比多農	15:1 對 1:5	5:1 對 1:2	3:1 對 1:2
必殺芬	12:1 對 1:9	4:1 對 1:3	2:1 對 1:3
保米黴素	3:1 對 1:90	1:1 對 1:30	1:4 對 1:30
白克列	18:1 對 1:6	6:1 對 1:2	4:1 對 1:2
溴克座	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3
布瑞莫	3:1 對 1:90	1:1 對 1:30	1:3 對 1:30
四氣丹	90:1 對 1:4	30:1 對 1:2	15:1 對 2:1
蓋普丹	90:1 對 1:4	30:1 對 1:2	15:1 對 2:1
貝芬替	45:1 對 1:4	15:1 對 1:2	11:1 對 2:1
萎鏽靈	18:1 對 1:6	6:1 對 1:2	4:1 對 1:2
加普胺	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3
二氣甲氧苯	300:1 對 2:1	100:1 對 4:1	100:1 對 14:1
四氣異苯腈	90:1 對 1:4	30:1 對 1:2	15:1 對 2:1
克氣得	45:1 對 1:2	15:1 對 2:1	11:1 對 2:1
克霉唑	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3
銅鹽如波多混合液(三元硫酸銅)、 氯氧化銅、硫酸銅與氫 氧化銅	450:1 對 1:1	150:1 對 4:1	45:1 對 5:1
賽座滅	4:1 對 1:18	1:1 對 1:6	1:1 對 1:6
賽芬胺	1:1 對 1:90	1:2 對 1:30	1:2 對 1:24
克絕	6:1 對 1:18	2:1 對 1:6	1:1 對 1:5
環克座	4:1 對 1:18	1:1 對 1:6	1:1 對 1:6
賽普洛	22:1 對 1:9	7:1 對 1:3	4:1 對 1:2
益發靈	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
雙氯氟菌胺	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
達滅淨	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3
大克爛	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
乙霉威	22:1 對 1:9	7:1 對 1:3	7:1 對 1:2
待克利	4:1 對 1:36	1:1 對 1:12	1:1 對 1:12
二氟林	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
二甲依瑞莫	3:1 對 1:90	1:1 對 1:30	1:3 對 1:30

104 年 6 月 8 日修正替換頁

組分(b)	典型 重量比	更典型 重量比	最典型 重量比
達滅芬	9:1 對 1:6	3:1 對 1:2	3:1 對 1:2
醚菌胺	9:1 對 1:18	3:1 對 1:6	2:1 對 1:4
達克利	3:1 對 1:36	1:1 對 1:12	1:1 對 1:8
達克利 M	3:1 對 1:90	1:1 對 1:30	1:1 對 1:12
白粉克	7:1 對 1:9	2:1 對 1:3	2:1 對 1:3
腈硫醌	15:1 對 1:4	5:1 對 1:2	5:1 對 1:2
十二環嗎啉	30:1 對 1:3	10:1 對 1:1	7:1 對 1:1
多寧	30:1 對 1:2	10:1 對 2:1	10:1 對 2:1
護粒松	30:1 對 1:9	10:1 對 1:3	3:1 對 1:3
烯肱菌酯	9:1 對 1:18	3:1 對 1:6	2:1 對 1:4
依普座	3:1 對 1:36	1:1 對 1:12	1:1 對 1:7
乙環唑	3:1 對 1:36	1:1 對 1:12	1:1 對 1:7
噻唑菌胺	7:1 對 1:9	2:1 對 1:3	2:1 對 1:3
依瑞莫	30:1 對 1:3	10:1 對 1:1	7:1 對 1:1
依得利	30:1 對 1:9	10:1 對 1:3	7:1 對 1:2
凡殺同	9:1 對 1:18	3:1 對 1:6	2:1 對 1:4
咪唑菌酮	6:1 對 1:18	2:1 對 1:6	2:1 對 1:4
芬瑞莫	3:1 對 1:90	1:1 對 1:30	1:2 對 1:24
芬克座	3:1 對 1:30	1:1 對 1:10	1:1 對 1:10
甲呋醯胺	18:1 對 1:6	6:1 對 1:2	4:1 對 1:2
環醯菌胺	30:1 對 1:2	10:1 對 2:1	10:1 對 2:1
芬諾尼	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 1:1
拌種咯	75:1 對 1:9	25:1 對 1:3	15:1 對 2:1
苯鏽啉	30:1 對 1:3	10:1 對 1:1	7:1 對 1:1
芬普福	30:1 對 1:3	10:1 對 1:1	7:1 對 1:1
胺苯吡菌酮	100:1 對 1:100	10:1 對 1:10	3:1 對 1:3
三苯錫鹽如三苯醋錫、三苯氣錫或三苯羥錫	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3
富爾邦	300:1 對 1:2	100:1 對 2:1	30:1 對 4:1
富米綜	30:1 對 1:5	10:1 對 1:2	7:1 對 1:2
扶吉胺	22:1 對 1:5	7:1 對 1:2	3:1 對 1:2
護汰寧	7:1 對 1:12	2:1 對 1:4	2:1 對 1:4
氟醯菌胺	9:1 對 1:6	3:1 對 1:2	3:1 對 1:2
氟嗎啉	9:1 對 1:18	3:1 對 1:6	3:1 對 1:3

104年6月8日修正替換頁

組分(b)	典型 重量比	更典型 重量比	最典型 重量比
氟比來	3:1 對 1:18	1:1 對 1:6	1:1 對 1:6
氟吡菌醯胺	15:1 對 1:90	5:1 對 1:30	3:1 對 1:3
氟氣菌核利(fluoromide)	150:1 對 2:1	50:1 對 4:1	37:1 對 5:1
氟啞菌酯	4:1 對 1:18	1:1 對 1:6	1:1 對 1:6
氟喹啉	4:1 對 1:12	1:1 對 1:4	1:1 對 1:4
護砂得	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3
氟硫滅	90:1 對 1:2	30:1 對 2:1	15:1 對 2:1
氟噻菌淨	7:1 對 1:36	2:1 對 1:12	1:1 對 1:6
福多寧	18:1 對 1:6	6:1 對 1:2	4:1 對 1:2
護汰芬	4:1 對 1:12	1:1 對 1:4	1:1 對 1:4
福熱殺(fluxapyroxad)	12:1 對 1:9	4:1 對 1:3	2:1 對 1:3
福爾培	90:1 對 1:4	30:1 對 1:2	15:1 對 2:1
福賽得	225:1 對 2:1	75:1 對 5:1	30:1 對 5:1
麥穗寧	45:1 對 1:4	15:1 對 1:2	11:1 對 2:1
呋霜靈	15:1 對 1:45	5:1 對 1:15	1:1 對 1:6
福拉比	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
克熱淨	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
菲克利	15:1 對 1:36	5:1 對 1:12	1:1 對 1:5
殺紋寧	225:1 對 2:1	75:1 對 4:1	75:1 對 9:1
依滅列	7:1 對 1:18	2:1 對 1:6	1:1 對 1:5
易胺座	15:1 對 1:36	5:1 對 1:12	1:1 對 1:5
愛得寶	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
種菌啞	15:1 對 1:36	5:1 對 1:12	1:1 對 1:5
丙基喜樂松	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
依普同	120:1 對 1:2	40:1 對 2:1	15:1 對 2:1
丙森鋅	9:1 對 1:9	3:1 對 1:3	2:1 對 1:3
亞賜圃	150:1 對 2:1	50:1 對 4:1	45:1 對 5:1
異吡聯(isopyrazam)	12:1 對 1:9	4:1 對 1:3	2:1 對 1:3
異噻菌胺	12:1 對 1:9	4:1 對 1:3	2:1 對 1:3
嘉賜徽素	7:1 對 1:90	2:1 對 1:30	1:2 對 1:24
克收欣	7:1 對 1:18	2:1 對 1:6	2:1 對 1:4
鋅錳乃浦	180:1 對 1:3	60:1 對 2:1	22:1 對 3:1
曼普胺	6:1 對 1:18	2:1 對 1:6	2:1 對 1:4
錳乃浦	180:1 對 1:3	60:1 對 2:1	22:1 對 3:1

組分(b)	典型 重量比	更典型 重量比	最典型 重量比
滅派林	18:1 對 1:3	6:1 對 1:1	6:1 對 1:1
甲呋醯胺	7:1 對 1:36	2:1 對 1:12	1:1 對 1:6
氧乙酸基白粉克	7:1 對 1:9	2:1 對 1:3	2:1 對 1:3
滅達樂	15:1 對 1:45	5:1 對 1:15	1:1 對 1:6
滅達樂-M	7:1 對 1:90	2:1 對 1:30	1:1 對 1:12
滅特座	3:1 對 1:18	1:1 對 1:6	1:1 對 1:6
滅速克	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 1:1
免得爛	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 1:1
苯氧菌胺	9:1 對 1:12	3:1 對 1:4	3:1 對 1:3
滅芬農	6:1 對 1:12	2:1 對 1:4	2:1 對 1:4
邁克尼	5:1 對 1:26	1:1 對 1:9	1:1 對 1:8
納芙迪芬	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
新阿蘇仁(鐵甲砷酸銨)	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
尼瑞莫	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3
辛噻酮	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 1:1
呋醯胺	15:1 對 1:45	5:1 對 1:15	1:1 對 1:6
肟醚菌胺	9:1 對 1:12	3:1 對 1:4	3:1 對 1:3
毆殺斯	15:1 對 1:45	5:1 對 1:15	1:1 對 1:6
歐索林酸	30:1 對 1:9	10:1 對 1:3	7:1 對 1:2
惡咪唑	15:1 對 1:36	5:1 對 1:12	1:1 對 1:5
嘉保信	18:1 對 1:6	6:1 對 1:2	4:1 對 1:2
氧四環素	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3
披扶座	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
平克座	1:1 對 1:45	1:2 對 1:15	1:2 對 1:15
賓克隆	150:1 對 1:2	50:1 對 2:1	11:1 對 2:1
派福芬	12:1 對 1:9	4:1 對 1:3	2:1 對 1:3
吡噻菌胺	12:1 對 1:9	4:1 對 1:3	2:1 對 1:3
亞磷酸及其鹽類	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
熱必斯	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
啉氧菌酯	7:1 對 1:18	2:1 對 1:6	1:1 對 1:5
粉病靈	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3
多氧菌素	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3
撲殺熱	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3
撲克拉	22:1 對 1:4	7:1 對 1:1	7:1 對 1:2

104年6月8日修正替換頁

組分(b)	典型 重量比	更典型 重量比	最典型 重量比
撲滅寧	45:1 對 1:3	15:1 對 1:1	11:1 對 2:1
普拔克或普拔克鹽酸鹽	30:1 對 1:2	10:1 對 2:1	10:1 對 2:1
普克利	4:1 對 1:18	1:1 對 1:6	1:1 對 1:5
甲基鋅乃浦	45:1 對 1:2	15:1 對 2:1	11:1 對 2:1
丙氧喹啉	3:1 對 1:36	1:1 對 1:12	1:1 對 1:12
胺丙威	9:1 對 1:18	3:1 對 1:6	3:1 對 1:3
丙硫菌唑	6:1 對 1:18	2:1 對 1:6	1:1 對 1:5
百克敏	9:1 對 1:18	3:1 對 1:6	2:1 對 1:4
唑胺菌酯	9:1 對 1:18	3:1 對 1:6	2:1 對 1:4
唑菌酯	9:1 對 1:18	3:1 對 1:6	2:1 對 1:4
白粉松	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 1:1
防霉丹	15:1 對 1:6	5:1 對 1:2	4:1 對 1:2
比芬諾	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3
派美尼	30:1 對 1:6	10:1 對 1:2	3:1 對 1:2
派芬農	6:1 對 1:12	2:1 對 1:4	2:1 對 1:4
百快隆	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3
吡咯菌素	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
奎因克座	4:1 對 1:12	1:1 對 1:4	1:1 對 1:4
滅蟪猛	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
快諾芬	4:1 對 1:18	1:1 對 1:6	1:1 對 1:6
五氯硝苯	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
矽噻菌胺	7:1 對 1:18	2:1 對 1:6	2:1 對 1:4
矽氟唑	15:1 對 1:36	5:1 對 1:12	1:1 對 1:5
萁孢菌素	22:1 對 1:4	7:1 對 1:2	5:1 對 1:2
鏈黴素	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3
硫	300:1 對 3:1	100:1 對 9:1	75:1 對 9:1
得克利	7:1 對 1:18	2:1 對 1:6	1:1 對 1:5
泰伏勤	100:1 對 1:100	10:1 對 1:10	3:1 對 1:3
克枯爛	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
四氯硝基苯	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
特比萘酚	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
四克利	15:1 對 1:36	5:1 對 1:12	1:1 對 1:5
腐絕	45:1 對 1:4	15:1 對 1:2	11:1 對 2:1
賽氟滅	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3

組分(b)	典型 重量比	更典型 重量比	最典型 重量比
多保淨	45:1 對 1:3	15:1 對 2:1	11:1 對 2:1
甲基多保淨	45:1 對 1:3	15:1 對 2:1	11:1 對 2:1
得恩地	150:1 對 1:2	50:1 對 2:1	37:1 對 5:1
噻醯菌胺	12:1 對 1:9	4:1 對 1:3	2:1 對 1:3
脫克松	150:1 對 1:2	50:1 對 2:1	37:1 對 5:1
甲基益發靈	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
三泰芬	15:1 對 1:36	5:1 對 1:12	1:1 對 1:5
三泰隆	15:1 對 1:36	5:1 對 1:12	1:1 對 1:5
噻菌醇	3:1 對 1:90	1:1 對 1:30	1:2 對 1:24
咪唑嗪	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	15:1 對 2:1
三賽唑	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3
三得芬	30:1 對 1:3	10:1 對 1:1	7:1 對 1:1
三氟敏	6:1 對 1:18	2:1 對 1:6	2:1 對 1:4
賽福座	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3
賽福寧	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3
三芬醯胺	45:1 對 1:9	15:1 對 1:3	7:1 對 1:2
滅菌唑	15:1 對 1:36	5:1 對 1:12	1:1 對 1:5
單克素	15:1 對 1:36	5:1 對 1:12	1:1 對 1:5
維利黴素	150:1 對 1:36	50:1 對 1:12	3:1 對 1:3
瓦芬耐	6:1 對 1:18	2:1 對 1:6	2:1 對 1:4
免克寧	120:1 對 1:2	40:1 對 2:1	15:1 對 2:1
鋅乃浦	150:1 對 1:2	50:1 對 2:1	37:1 對 5:1
福美鋅	150:1 對 1:2	50:1 對 2:1	37:1 對 5:1
座賽胺	6:1 對 1:18	2:1 對 1:6	2:1 對 1:4
5-氯-6-(2,4,6-三氯苯基)-7-(4- 甲吡啶-1-基)[1,2,4]三唑并 [1,5-a]嘧啶	15:1 對 1:36	5:1 對 1:12	1:1 對 1:6
N-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔 -1-基]氧基]-3-甲氧苯基]乙 基]-3-甲基-2-[(甲磺醯基)胺 基]丁醯胺	6:1 對 1:18	2:1 對 1:6	2:1 對 1:4
N-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔 -1-基]氧基]-3-甲氧苯基]乙 基]-3-甲基-2-[(乙磺醯基)胺 基]丁醯胺	6:1 對 1:18	2:1 對 1:6	2:1 對 1:4
2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4H-1-	3:1 對 1:36	1:1 對 1:12	1:1 對 1:12

組分(b)	典型 重量比	更典型 重量比	最典型 重量比
苯并哌喃-4-酮			
3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基-3-異噁唑啉基]吡啶	15:1 對 1:9	5:1 對 1:3	3:1 對 1:3
<i>N'</i> -[4-[[3-[(4-氯苯基)甲基]-1,2,4-噻二唑-5-基]氧基]-2,5-二甲苯基]- <i>N</i> -乙基- <i>N</i> -甲基甲醯亞胺醯胺	20:1 對 1:20	8:1 對 1:8	3:1 對 1:3
<i>N</i> -[1-[[[1-(4-氯苯基)乙基]磺醯基]甲基]丙基]胺基甲酸 4-氯苯酯	6:1 對 1:18	2:1 對 1:6	2:1 對 1:4
<i>N</i> -[[環丙甲氧基]胺基][6-(二氯甲氧基)-2,3-二氯苯基]亞甲基]苯乙醯胺	1:1 對 1:90	1:2 對 1:30	1:2 對 1:24
α -[甲氧亞胺基]- <i>N</i> -甲基-2-[[[1-[3-(三氯甲基)苯基]乙氧基]亞胺基]甲基]苯乙醯胺	9:1 對 1:18	3:1 對 1:6	3:1 對 1:3
<i>N'</i> -[4-[4-氯-3-(三氯甲基)苯氧基]-2,5-二甲苯基]- <i>N</i> -乙基- <i>N</i> -甲基甲醯亞胺醯胺	15:1 對 1:18	5:1 對 1:6	3:1 對 1:3
<i>N</i> -(4-氯-2-硝苯基)- <i>N</i> -乙基-4-甲苯磺醯胺	15:1 對 1:18	5:1 對 1:6	3:1 對 1:3
2-[[[3-(2,6-二氯苯基)-1-甲基-2-丙烯-1-亞基]胺基]氧基]甲基]- α -(甲氧亞胺基)- <i>N</i> -甲苯乙醯胺	9:1 對 1:18	3:1 對 1:6	3:1 對 1:3
<i>N</i> -[4-[[[(1-甲基-1 <i>H</i> -四唑-5-基)苯亞甲基]胺基]氧基]甲基]-2-噻唑基]胺基甲酸戊酯	9:1 對 1:18	3:1 對 1:6	3:1 對 1:3
<i>N</i> -[6-[[[(1-甲基-1 <i>H</i> -四唑-5-基)苯亞甲基]胺基]氧基]甲基]-2-吡啶基]胺基甲酸戊酯	9:1 對 1:18	3:1 對 1:6	3:1 對 1:3
2-[(3-溴-6-喹啉基)氧基]- <i>N</i> -(1,1-二甲基-2-丁炔-1-基)-2-(甲硫基)乙醯胺	5:1 對 1:22	2:1 對 1:8	2:1 對 1:4
2-[(3-乙炔基-6-喹啉基)氧基]- <i>N</i> -[1-(羥甲基)-1-甲基-2-丙炔-1-基]-2-(甲硫基)乙醯胺	5:1 對 1:22	2:1 對 1:8	2:1 對 1:4
<i>N</i> -(1,1-二甲基-2-丁炔-1-基)-2-[(3-乙炔基-6-喹啉基)氧基]-2-(甲硫基)乙醯胺	5:1 對 1:22	2:1 對 1:8	2:1 對 1:4

如同已指明者，本發明包括其中組成物包含組分(a)與組分(b)之實施例，組分(b)包含至少一種來自選自(b1)至(b46)之兩個不同群組的各個群組的殺真菌化合物。表 C1 至 C43 列出特定混合物(化合物編號參照索引表 A 中之化合物)以說明其中組分(b)包含至少一種殺真菌化合物之實施例，該殺真菌化合物來自選自(b1)至(b46)之兩個不同群組的各個群組。在表 C1 中，在欄位標題「組分(a)」以及「組分(b)」下之各行特定揭露一種組分(a)(其為化合物 3)與至少兩種組分(b)殺真菌化合物之混合物。標題「說明性比例」下的項目揭露在該揭露混合物中，組分(a)對各個組分(b)殺真菌化合物的三種特定重量百分比。例如，第一行揭露一種化合物 3 與環克座及亞托敏之混合物，並列出化合物 3 對環克座對亞托敏之重量比例為 1:1:1、2:1:1 或 3:1:1。

表 C1

組分(a)	組分(b)	說明性比例(*)
化合物 3	環克座 亞托敏	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 3	環克座 克收欣	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 3	環克座 啉氧菌酯	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 3	環克座 百克敏	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 3	環克座 唑胺菌酯	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 3	環克座 唑菌酯	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 3	環克座 三氟敏	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 3	環克座 必殺芬	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 3	環克座 白克列	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 3	環克座 賽芬胺	1:2:1 2:2:1 3:2:1
化合物 3	環克座 氟吡菌醯胺	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 3	環克座 異吡聯 (isopyrazam)	1:1:2 2:1:2 3:1:2

104 年 6 月 8 日修正替換頁

組分(a)	組分(b)	說明性比例(*)		
化合物 3	環克座 滅芬農	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	環克座 吡嗪菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	環克座 丙氧嗪啉	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	環克座 派芬農	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	環克座 快諾芬	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	環克座 環丙吡菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	環克座 啉氧菌酯 丙氧嗪啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	環克座 三氟敏 丙氧嗪啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	待克利 亞托敏	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	待克利 克收欣	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	待克利 啉氧菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	待克利 百克敏	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	待克利 唑胺菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	待克利 唑菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	待克利 三氟敏	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	待克利 必殺芬	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	待克利 白克列	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	待克利 賽芬胺	1:2:1	2:2:1	3:2:1
化合物 3	待克利 氟吡菌醯胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	待克利 異吡聯 (isopyrazam)	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	待克利 滅芬農	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	待克利 吡嗪菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	待克利 丙氧嗪啉	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	待克利 派芬農	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	待克利 快諾芬	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	待克利 環丙吡菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	待克利 啉氧菌酯 丙氧嗪啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	待克利 三氟敏 丙氧嗪啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	依普座 亞托敏	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	依普座 克收欣	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	依普座 啉氧菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	依普座 百克敏	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	依普座 唑胺菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	依普座 唑菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	依普座 三氟敏	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	依普座 必殺芬	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	依普座 白克列	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	依普座 賽芬胺	1:2:1	2:2:1	3:2:1
化合物 3	依普座 氟吡菌醯胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2

組分(a)	組分(b)	說明性比例(*)		
化合物 3	依普座 異吡聯 (isopyrazam)	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	依普座 滅芬農	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	依普座 吡噻菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	依普座 丙氧喹啉	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	依普座 派芬農	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	依普座 快諾芬	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	依普座 環丙吡菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	依普座 啞氧菌酯 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	依普座 三氟敏 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	滅特座 亞托敏	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	滅特座 克收欣	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	滅特座 啞氧菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	滅特座 百克敏	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	滅特座 唑胺菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	滅特座 唑菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	滅特座 三氟敏	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	滅特座 必殺芬	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	滅特座 白克列	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	滅特座 賽芬胺	1:2:1	2:2:1	3:2:1
化合物 3	滅特座 氟吡菌醯胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	滅特座 異吡聯 (isopyrazam)	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	滅特座 滅芬農	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	滅特座 吡噻菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	滅特座 丙氧喹啉	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	滅特座 派芬農	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	滅特座 快諾芬	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	滅特座 環丙吡菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	滅特座 啞氧菌酯 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	滅特座 三氟敏 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	邁克尼 亞托敏	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	邁克尼 克收欣	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	邁克尼 啞氧菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	邁克尼 百克敏	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	邁克尼 唑胺菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	邁克尼 唑菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	邁克尼 三氟敏	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	邁克尼 必殺芬	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	邁克尼 白克列	1:1:2	2:1:2	3:1:2

104 年 6 月 8 日修正替換頁

組分(a)	組分(b)	說明性比例(*)		
化合物 3	邁克尼 賽芬胺	1:2:1	2:2:1	3:2:1
化合物 3	邁克尼 氟吡菌醯胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	邁克尼 異吡聯 (isopyrazam)	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	邁克尼 滅芬農	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	邁克尼 吡噻菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	邁克尼 丙氧喹啉	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	邁克尼 派芬農	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	邁克尼 快諾芬	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	邁克尼 環丙吡菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	邁克尼 啉氧菌酯 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	邁克尼 三氟敏 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	丙硫菌唑 亞托敏	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	丙硫菌唑 克收欣	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	丙硫菌唑 啉氧菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	丙硫菌唑 百克敏	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	丙硫菌唑 唑胺菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	丙硫菌唑 唑菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	丙硫菌唑 三氟敏	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	丙硫菌唑 必殺芬	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	丙硫菌唑 白克列	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	丙硫菌唑 賽芬胺	1:2:1	2:2:1	3:2:1
化合物 3	丙硫菌唑 氟吡菌醯胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	丙硫菌唑 異吡聯 (isopyrazam)	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	丙硫菌唑 滅芬農	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	丙硫菌唑 吡噻菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	丙硫菌唑 丙氧喹啉	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	丙硫菌唑 派芬農	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	丙硫菌唑 快諾芬	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	丙硫菌唑 環丙吡菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	丙硫菌唑 啉氧菌酯 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	丙硫菌唑 三氟敏 丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 3	得克利 亞托敏	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	得克利 克收欣	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	得克利 啉氧菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	得克利 百克敏	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	得克利 唑胺菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	得克利 唑菌酯	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	得克利 三氟敏	1:1:1	2:1:1	3:1:1

組分(a)	組分(b)	說明性比例(*)		
化合物 3	得克利 必殺芬	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	得克利 白克列	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	得克利 賽芬胺	1:2:1	2:2:1	3:2:1
化合物 3	得克利 氟吡菌醯胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	得克利 異吡聯 (isopyrazam)	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	得克利 滅芬農	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	得克利 吡噻菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	得克利 丙氧喹啉	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	得克利 派芬農	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	得克利 快諾芬	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 3	得克利 環丙吡菌胺	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 3	得克利 啞氧菌酯	丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1 3:1:1:1
化合物 3	得克利 三氟敏	丙氧喹啉	1:1:1:1	2:1:1:1 3:1:1:1

(*) 組分(a)依序相對於組分(b)之重量比例。

表 C2 至 C43 除了「組分(a)」欄位標題係以下示之各別組分(a)欄位項目代替之外，各與上述表 C1 架構相同。因此，例如在表 C2 中，在「組分(a)」欄位標題下之項目均標示為「化合物 7」，在表 C2 欄位標題下之第一行特定揭露一種化合物 7 與環克座及亞托敏之混合物，且化合物 7：環克座：亞托敏的說明性重量比例為 1:1:1、2:1:1 與 3:1:1。表 C3 至 C43 係類似架構。

表格編號	組分(a)欄位項目	表格編號	組分(a)欄位項目
C2	化合物 7	C23	化合物 252
C3	化合物 8	C24	化合物 253
C4	化合物 13	C25	化合物 254
C5	化合物 17	C26	化合物 257
C6	化合物 40	C27	化合物 258
C7	化合物 47	C28	化合物 259
C8	化合物 81	C29	化合物 260
C9	化合物 82	C30	化合物 261

C10	化合物 122	C31	化合物 262
C11	化合物 136	C32	化合物 263
C12	化合物 143	C33	化合物 264
C13	化合物 144	C34	化合物 265
C14	化合物 161	C35	化合物 266
C15	化合物 195	C36	化合物 267
C16	化合物 238	C37	化合物 268
C17	化合物 239	C38	化合物 269
C18	化合物 240	C39	化合物 270
C19	化合物 241	C40	化合物 271
C20	化合物 244	C41	化合物 273
C21	化合物 245	C42	化合物 275
C22	化合物 247	C43	化合物 276

值得注意的本發明組成物包含一式 1 化合物(或一其 *N*-氧化物或其鹽)，並具有至少一種其他殺真菌化合物，其具有與該式 1 化合物不同之作用位點。在某些例子中，具有至少一種其他殺真菌化合物(具有類似防治範圍但不同之作用位點)之組合物對於抗性管理特別有利。因此，一本發明組成物可有利地包含至少一種殺真菌活性化合物，其選自於上述由(b1)至(b46)所組成的群組，其具有類似防治範圍但不同之作用位點。

組分(a)之組成物或組分(a)及組分(b)，可進一步與一或多種其他生物活性化合物或藥劑混合，包括殺蟲劑、殺線蟲劑、殺菌劑、殺蟎劑、除草劑、除草劑保護劑、生長調節素如昆蟲蛻皮抑制劑與生根刺激劑、化學滅菌劑、化學傳訊物質、驅蟲劑、誘引劑、費洛蒙、激食因子、植物營養素、其他生物活性化合物或蟲生細菌、病毒或真菌，以形成多重組分之殺蟲劑而得到更寬

廣的農業保護範圍。因此本發明亦適用於一包含一殺真菌有效量之組分(a)，或一組分(a)及組分(b)之混合物，與一生物有效量之至少一種額外生物活性化合物或藥劑，並可進一步包含至少一種表面活性劑、固體稀釋劑或液體稀釋劑。其他生物活性化合物或藥劑亦可分開配製於組成物中，該組成物包含至少一種表面活性劑、固體或液體稀釋劑。對於本發明組成物而言，一或多種其他生物活性化合物或藥劑可與組分(a)及(b)中的一者或兩者一起配製，以形成一個預混物，或一或多種其他生物活性化合物或藥劑可與組分(a)以及(b)分開配製，並且該製劑在施用前先行結合(例如在一個噴灑桶中)，或是連續施用。

可與組分(a)之組成物或組分(a)及組分(b)一起配製的此類生物活性化合物或藥劑為：殺蟲劑如阿巴汀、毆殺松、亞滅培、乙醯蟲腈(acetoprole)、阿納寧、得滅克、磺胺蟎酯、三亞蹠、阿佛菌素、印棟素、谷速松、畢芬寧、聯苯腈酯、雙三氟蟲脲、布芬淨、加保扶、培丹、蟎離丹、克凡派、克福隆、剋安勃、陶斯松、甲基陶斯松、克氯苯、可芬諾、可尼丁、氰特破、賽芬蟎、賽扶寧、貝他-賽扶寧、賽洛寧、加馬-賽洛寧、拉目達-賽洛寧、錫蟎丹、賽滅寧、賽滅淨、第滅寧、汰芬隆、大利松、大克蟎、地特靈、得氯蟎、二福隆、四氟甲醚菊酯、大滅松、達特南、苯蟲醚、因滅汀、安殺番、益化利、乙蟲清、依殺蟎、芬滅松、芬殺蟎、芬佈賜、芬硫克、芬諾克、芬普寧、芬普蟎、芬化利、芬普尼、氟尼胺、氟蟲醯胺、護賽寧、陶-福化利、嘜蟲胺、氟芬隆、大

福松、合芬隆、六伏隆、合賽多、愛美松、新煙鹼類、益達胺、因得克、亞芬松、祿芬隆、馬拉松、氯氟醚菊酯、美氟綜、滅蝸靈、達馬松、滅大松、納乃得、美賜平、甲氧 DDT、滅芬諾、美特寧、倍脈心肝、亞素靈、菸鹼、烯啶蟲胺、尼殺賽、諾伐隆、諾伏隆、毆殺滅、巴拉松、巴拉松-甲基、百滅寧、福瑞松、裕必松、益滅松、福賜米松、比加普、佈飛松、佈福靈、毆蟎多、胺丙威、佈芬佈、派滅淨、派福羅、除蟲菊精、畢達本、啞蟲丙醚、披福貴、披綠羅、百利普芬、魚藤精、魚尼丁、賜托拉、賜諾殺、賜派芬(spiridiclofen)、螺甲蟎酯、螺蟲乙酯、賜殺羅、甲丙硫磷、得芬諾、得芬瑞、得福、七氟菊酯、托福松、殺蟲畏、四甲氟菊酯、賽果培、賽速安、硫敵克、殺蟲單、脫芬瑞、泰滅寧、啞蚱威、三氯松、三福隆；殺線蟲劑如得滅克(aldicarb)、新煙鹼類(imicyafos)、毆殺滅(oxamyl)及芬滅松(fenamiphos)；殺菌劑如鏈黴素；殺蟎劑如三亞蹠、蟎離丹、克氯苯、西諾比拉芬(cyenopyrafen)、錫蟎丹、大克蟎、得氯蟎、依殺蟎、芬殺蟎、芬佈賜、芬普寧、芬普蟎、合賽多、毆蟎多、畢達本與得芬瑞；以及包括蟲生細菌的生物藥劑，像是蘇力菌鮎澤亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*)、蘇力菌庫斯塔克亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*)、與蘇力菌之膠囊化德他-內毒素(*Bacillus thuringiensis*(如 Cellcap, MPV, MPVII)；蟲生真菌如綠殭菌(green muscardine fungus)；及昆蟲病原病毒，包括桿狀病毒、核多角體病毒(NPV)，如美洲棉鈴蟲核型多角體病毒(HzNPV)、安那葛福核多角體病毒

(AfNPV)；及顆粒體病毒(GV)如卷葉蛾顆粒體病毒(CpGV)。

這些農業保護劑(即殺蟲劑、殺真菌劑、殺線蟲劑、殺蟎劑、除草劑與生物劑)的一般參考文獻包括 *The Pesticide Manual, 13th Edition*，C. D. S. Tomlin 編輯，British Crop Protection Council，Farnham，Surrey，U.K.，2003 及 *The BioPesticide Manual*，第 2 版，L. G. Copping 編輯，British Crop Protection Council，Farnham，Surrey，U.K.，2001。

對於其中使用一或多種這些各式混合伙伴藥劑的實施例而言，這些各式混合伙伴藥劑(總計)對組分(a)之重量比例，或其對組分(a)及組分(b)之混合物的重量比例，通常介於約 1:3000 與約 3000:1 間。值得注意的重量比例為介於約 1:100 與約 3000:1 間，或介於約 1:30 與約 300:1 間(例如介於約 1:1 與約 30:1 間之比例)。顯然地，相較於單獨使用組分(a)或組分(a)及組分(b)之混合物所能防治的範圍，包括這些額外組分可能擴大對於病害的防治範圍。

組分(a)化合物與/或其與組分(b)化合物之組合物與/或一或多種其他生物活性化合物或藥劑可施用於基因改造植物，以對無脊椎害蟲表現毒性蛋白(如蘇力菌德他-內毒素)。單獨外用本組分(a)或組合外用組分(a)與組分(b)的效果可與表現的毒性蛋白協同作用。

值得注意的組合物或組成物為包含組分(a)或組分(a)與(b)者，組分(b)如描述於發明內容者且進一步包含至少一種無脊椎害蟲防治化合物或藥劑(例如殺蟲劑、

殺蟎劑)。值得特別注意的組成物為包含組分(a)及至少一種(即一種或多種)無脊椎害蟲防治化合物或藥劑，其隨後可與組分(b)結合以提供一包含組分(a)及(b)與一或多種無脊椎害蟲防治化合物或藥劑的組成物。或者，在未先與組分(b)混合的情況下，可將包含組分(a)與至少一種無脊椎害蟲防治劑之組成物，以一生物有效量施予植物或植物種子(直接或透過植物或植物種子之環境)，以保護植物或植物種子免於感染真菌類病原體造成之病害及由無脊椎害蟲造成之損害。

對於其中使用一或多種之無脊椎害蟲防治化合物之實施例，這些化合物(總計)對組分(a)化合物之典型重量比例介於約 1:3000 至約 3000:1 間。值得注意的是介於約 1:300 至約 300:1 之間之重量比例(例如介於約 1:30 至約 30:1 間之比例)。熟習該項技術者可經由簡單實驗，迅速決定活性成分達成所需生物活性範圍必要之生物有效量。

值得注意的本發明組成物，其除了包含一組分(a)化合物(單獨或與組分(b)組合)外，尚包含至少一種選自以下所組成之群組的無脊椎害蟲防治化合物或藥劑：阿巴汀、毆殺松、亞滅培、乙醯蟲脞、阿納寧、得滅克、磺胺蟎酯、三亞蹠、阿佛菌素、印棟素、谷速松、畢芬寧、聯苯腈酯、雙三氟蟲脲、布芬淨、加保扶、培丹、蟎離丹、克凡派、克福隆、剋安勃、陶斯松、甲基陶斯松、克氯苯、可芬諾、可尼丁、氰特破、賽芬蟎、賽扶寧、貝他-賽扶寧、賽洛寧、加馬-賽洛寧、拉目達-賽洛寧、錫蟎丹、賽滅寧、賽滅淨、第滅寧、汰芬隆、大利

松、大克蟎、地特靈、得氯蟎、二福隆、四氟甲醚菊酯、大滅松、達特南、苯蟲醚、因滅汀、安殺番、益化利、乙蟲清、依殺蟎、芬滅松、芬殺蟎、芬佈賜、芬硫克、芬諾克、芬普寧、芬普蟎、芬化利、芬普尼、氟尼胺、氟蟲醯胺、護賽寧、陶-福化利、啞蟲胺、氟芬隆、大福松、合芬隆、六伏隆、合賽多、愛美松、新煙鹼類、益達胺、因得克、亞芬松、祿芬隆、馬拉松、氯氟醚菊酯、美氟綜、滅蝸靈、達馬松、滅大松、納乃得、美賜平、甲氧 DDT、滅芬諾、美特寧、倍脈心肝、亞素靈、菸鹼、烯啶蟲胺、尼殺賽、諾伐隆、諾伏隆、毆殺滅、巴拉松、巴拉松-甲基、百滅寧、福瑞松、裕必松、益滅松、福賜米松、比加普、佈飛松、佈福靈、毆蟎多、佈芬佈、派滅淨、派福羅、除蟲菊精、畢達本、啶蟲丙醚、披福貴、披綠羅、百利普芬、魚藤精、魚尼丁、賜托拉、賜諾殺、賜派芬、螺甲蟎酯、螺蟲乙酯、賜殺羅、甲丙硫磷、得芬諾、得芬瑞、得福、七氟菊酯、托福松、殺蟲畏、四甲氟菊酯、賽果培、賽速安、硫敵克、殺蟲單、脫芬瑞、泰滅寧、啞蚜威、三氯松、三福隆、蘇力菌鮎澤亞種、蘇力菌庫斯塔克亞種、核多角體病毒、蘇力菌之膠囊化德他-內毒素、桿狀病毒、蟲生細菌、蟲生病毒與蟲生真菌。值得注意的是前述列示者排除每吡蜉新(meperflutrin)、賜殺羅(sulfoxaflor)與四甲氟菊酯。

在某些例子中，組分(a)化合物(單獨或與組分(b)混合)及其他生物活性(特別是無脊椎害蟲防治)化合物或藥劑(即活性成分)之組成物可導致大於加成性(即協同作用)之效果。理想總是降低活性成分於環境的排放

量，同時確保有效之害蟲防治效果。當無脊椎害蟲防治活性成分於施用比例展現農藝上足夠程度之無脊椎動物害蟲防治協同作用，此類組合物可有利於減少作物生產成本及降低環境負擔。

表 D1 列出無脊椎害蟲防治劑與化合物 3(如索引表 A 中所示)作為組分(a)化合物之特定組合物，其說明依據本發明包含這些活性成分之混合物及組成物和其使用方法。表 D1 第二欄列出該特定無脊椎害蟲防治劑(例如第一行中的「阿巴汀」)。表 D1 第三欄列出該無脊椎害蟲防治劑作用模式(若為已知)或化學分類。表 D1 第四欄列出實施例之重量比例範圍，其為該無脊椎害蟲防治劑相對於化合物 3(單獨或與組分(b)組合)之典型施用率(例如「50:1 至 1:50」的阿巴汀相對於化合物 3，以重量計)。因此，例如表 D1 第一行特定揭露化合物 3 與阿巴汀之組合物典型以介於 50:1 至 1:50 間的重量比例施用。表 D1 其餘行的架構類似。

表 D1

組分(a)	無脊椎害蟲防治劑	作用方式或化學分類	典型 重量比例
化合物 3	阿巴汀	巨環內酯類	50:1 對 1:50
化合物 3	亞滅培	新菸鹼類	150:1 對 1:200
化合物 3	雙甲脒	章魚胺受體配位體	200:1 對 1:100
化合物 3	阿佛菌素	巨環內酯類	50:1 對 1:50
化合物 3	印楝素	蛻皮激素促效劑	100:1 對 1:120
化合物 3	貝他-賽扶寧	鈉通道調控劑	150:1 對 1:200
化合物 3	畢芬寧	鈉通道調控劑	100:1 對 1:10
化合物 3	布芬淨	幾丁質合成抑制劑	500:1 對 1:50
化合物 3	培丹	沙蠶毒素類似物	100:1 對 1:200

組分(a)	無脊椎害蟲防治劑	作用方式或化學分類	典型 重量比例
化合物 3	剋安勃	魚尼丁受體配位體	100:1 對 1:120
化合物 3	克凡派	粒線體電子傳遞抑制劑	300:1 對 1:200
化合物 3	陶斯松	膽鹼酯酶抑制劑	500:1 對 1:200
化合物 3	可尼丁	新菸鹼類	100:1 對 1:400
化合物 3	氟特破	魚尼丁受體配位體	100:1 對 1:120
化合物 3	賽扶寧	鈉通道調控劑	150:1 對 1:200
化合物 3	賽洛寧	鈉通道調控劑	150:1 對 1:200
化合物 3	賽滅寧	鈉通道調控劑	150:1 對 1:200
化合物 3	賽滅淨	幾丁質合成抑制劑	400:1 對 1:50
化合物 3	第滅寧	鈉通道調控劑	50:1 對 1:400
化合物 3	地特靈	環二烯殺蟲劑類	200:1 對 1:100
化合物 3	達特南	新菸鹼類	150:1 對 1:200
化合物 3	苯蟲醚	蛻皮抑制劑	150:1 對 1:200
化合物 3	因滅汀	巨環內酯類	50:1 對 1:10
化合物 3	安殺番	環二烯殺蟲劑類	200:1 對 1:100
化合物 3	益化利	鈉通道調控劑	100:1 對 1:400
化合物 3	乙蟲清	GABA 調節氯離子通道 阻斷劑	200:1 對 1:100
化合物 3	芬硫克		150:1 對 1:200
化合物 3	芬諾克	青春激素模擬物	500:1 對 1:100
化合物 3	芬化利	鈉通道調控劑	150:1 對 1:200
化合物 3	芬普尼	GABA 調節氯離子通道 阻斷劑	150:1 對 1:100
化合物 3	氟尼胺		200:1 對 1:100
化合物 3	氟蟲醯胺	魚尼丁受體配位體	100:1 對 1:120
化合物 3	氟芬隆	幾丁質合成抑制劑	200:1 對 1:100
化合物 3	六伏隆	幾丁質合成抑制劑	300:1 對 1:50
化合物 3	愛美松	粒線體電子傳遞抑制劑	150:1 對 1:250
化合物 3	益達胺	新菸鹼類	1000:1 對 1:1000
化合物 3	因得克	鈉通道調控劑	200:1 對 1:50
化合物 3	拉目達-賽洛寧	鈉通道調控劑	50:1 對 1:250
化合物 3	祿芬隆	幾丁質合成抑制劑	500:1 對 1:250
化合物 3	氣氟醚菊酯	鈉通道調控劑	100:1 對 1:400
化合物 3	美氟綜		200:1 對 1:200
化合物 3	納乃得	膽鹼酯酶抑制劑	500:1 對 1:100
化合物 3	美賜平	青春激素模擬物	500:1 對 1:100

組分(a)	無脊椎害蟲防治劑	作用方式或化學分類	典型 重量比例
化合物 3	滅芬諾	蛻皮激素促效劑	50:1 對 1:50
化合物 3	烯啶蟲胺	新菸鹼類	150:1 對 1:200
化合物 3	尼殺賽	新菸鹼類	150:1 對 1:200
化合物 3	諾伐隆	幾丁質合成抑制劑	500:1 對 1:150
化合物 3	毆殺滅	膽鹼酯酶抑制劑	200:1 對 1:200
化合物 3	派滅淨		200:1 對 1:100
化合物 3	除蟲菊精	鈉通道調控劑	100:1 對 1:10
化合物 3	畢達本	粒線體電子傳遞抑制劑	200:1 對 1:100
化合物 3	啞蟲丙醚		200:1 對 1:100
化合物 3	百利普芬	青春激素模擬物	500:1 對 1:100
化合物 3	魚尼丁	魚尼丁受體配位體	100:1 對 1:120
化合物 3	賜托拉	巨環內酯類	150:1 對 1:100
化合物 3	賜諾殺	巨環內酯類	500:1 對 1:10
化合物 3	賜派芬	脂質生合成抑制劑	200:1 對 1:200
化合物 3	甲蟎酯	脂質生合成抑制劑	200:1 對 1:200
化合物 3	賜殺羅		200:1 對 1:200
化合物 3	得芬諾	蛻皮激素促效劑	500:1 對 1:250
化合物 3	四甲氟菊酯	鈉通道調控劑	100:1 對 1:40
化合物 3	賽果培	新菸鹼類	100:1 對 1:200
化合物 3	賽速安	新菸鹼類	1250:1 對 1:1000
化合物 3	硫敵克	膽鹼酯酶抑制劑	500:1 對 1:400
化合物 3	殺蟲單		150:1 對 1:100
化合物 3	泰滅寧	鈉通道調控劑	150:1 對 1:200
化合物 3	啞蚱威	膽鹼酯酶抑制劑	250:1 對 1:100
化合物 3	三福隆	幾丁質合成抑制劑	200:1 對 1:100
化合物 3	蘇力菌	生物劑	50:1 對 1:10
化合物 3	蘇力菌德他-內毒素	生物劑	50:1 對 1:10
化合物 3	NPV(如 Gemstar)	生物劑	50:1 對 1:10

表 D2 至 D43 除了「組分(a)」欄位標題下之項目各別依下列組分(a)欄位名稱代替之外，其餘各以同上述表 D1 之方式架構。因此，例如在表 D2 中，在「組分(a)」欄位標題下之項目均標示為「化合物 7」，而在表 D2 中

欄位標題下第一行特定揭露一種化合物 7 與阿巴汀之混合物。表 D3 至 D43 架構類似。

表格編號	組分(a)欄位名稱	表格編號	組分(a)欄位名稱
D2	化合物 7	D23	化合物 252
D3	化合物 8	D24	化合物 253
D4	化合物 13	D25	化合物 254
D5	化合物 17	D26	化合物 257
D6	化合物 40	D27	化合物 258
D7	化合物 47	D28	化合物 259
D8	化合物 81	D29	化合物 260
D9	化合物 82	D30	化合物 261
D10	化合物 122	D31	化合物 262
D11	化合物 136	D32	化合物 263
D12	化合物 143	D33	化合物 264
D13	化合物 144	D34	化合物 265
D14	化合物 161	D35	化合物 266
D15	化合物 195	D36	化合物 267
D16	化合物 238	D37	化合物 268
D17	化合物 239	D38	化合物 269
D18	化合物 240	D39	化合物 270
D19	化合物 241	D40	化合物 271
D20	化合物 244	D41	化合物 273
D21	化合物 245	D42	化合物 275
D22	化合物 247	D43	化合物 276

一用於與組分(a)化合物混合之無脊椎害蟲防治劑(例如殺蟲劑與殺蟎劑)實施例包括鈉通道調控劑，如畢芬寧、賽滅寧、賽洛寧、拉目達-賽洛寧、賽扶寧、貝他-賽扶寧、第滅寧、四氟甲醚菊酯、益化利、芬化利、因得克、氯氟醚菊酯、美特寧、佈福靈、除蟲菊精、四甲氟菊酯與泰滅寧；膽鹼酯酶抑制劑，如陶斯松、納乃

得、毆殺滅、硫敵克與唑蚜威；新菸鹼類，如亞滅培、可尼丁、達特南、益達胺、烯啶蟲胺、尼殺賽、賽果培與賽速安；殺蟲巨環內酯，如賜托拉、賜諾殺、阿巴汀、阿佛菌素與因滅汀；GABA (γ -胺基丁酸)調節之氯離子通道阻斷劑，如安殺番、乙蟲清與芬普尼；幾丁質合成抑制劑，如布芬淨、賽滅淨、氟芬隆、六伏隆、祿芬隆、諾伐隆、諾伏隆與三福隆；青春激素類似物，如苯蟲醚、芬諾克、美賜平與百利普芬；章魚胺受體配位體，例如三亞蹠；蛻皮激素促效劑，如印棟素、滅芬諾與得芬諾；魚尼丁受體配位體如魚尼丁、鄰胺苯甲二鹽胺如剋安勃、氰特破及氟蟲鹽胺；沙蠶毒素類似物，如培丹；粒線體電子傳遞抑制劑，如克凡派、愛美松及畢達本；脂質合成抑制劑，如賜派芬及螺甲蟎酯；環二烯殺蟲劑，如地特靈；賽芬蟎；芬硫克；氟尼胺；美氟綜；派福羅；啞蟲丙醚；披綠羅；派滅淨；螺蟲乙酯；及殺蟲單。一個用於與組分(a)之化合物混合之生物劑的實施例包括核多角體病毒如 HzNPV 及 AfNPV；蘇力菌與蘇力菌之膠囊化德他-內毒素，如 Cellcap、MPV 與 MPVII；以及天然及基因改造病毒殺蟲劑，包含桿狀病毒科(Baculoviridae)家族的成員以及食蟲真菌。值得注意的是，一種包含組分(a)與至少一種選自上表 D1 中所列無脊椎害蟲防治劑之其他生物活性化合物或藥劑之組成物。

本發明組成物可用作為植物病害防治劑。因此本發明進一步包含一種用於防治由真菌類植物病原體造成之植物病害的方法，該方法包含施予待保護植物或其部分或待保護植物種子或營養繁殖單元，一殺真菌有效量

之本發明組成物(例如一包含組分(a)或組分(a)與(b)之組成物)。本發明之此態樣亦可描述為一種用於保護植物或植物種子免於感染由真菌類病原體引起之病害的方法，其包含施予一殺真菌有效量的本發明組成物(直接或透過該植物或植物種子的環境(例如生長介質))至該植物(或其部分)或植物種子。

植物病害防治通常藉由將一有效量之本發明組成物(例如包含組分(a)或一組分(a)與(b)之混合物)，典型為一經配製組成物，無論是在感染前或感染後，施予在待保護植物之部分如根、莖、葉、果、種子、塊莖、球莖或待保護植物生長之介質(土或砂)而達成。組分(a)或其混合物亦可施用於種子以保護種子與由該種子長出之幼苗。該些混合物亦可透過灌溉用水施用來處理植物。

組分(a)(即至少一種選自式 1 化合物、其 *N*-氧化物及其鹽之化合物)之合適施用率(即殺真菌有效量)以及根據此發明包含組分(a)之混合物與組成物的合適施用率(例如生物有效量、殺真菌有效量或殺蟲有效量)，可受許多環境因素影響並應根據實際使用條件決定。當以少於約 1 g/ha 到約 5,000 g/ha 之施用率處理時，通常可以保護葉子。當以約每公斤種子約 0.1 至約 10 g 的施用率處理種子時，通常可以保護種子和幼苗；且當以每公斤營養繁殖單元約 0.1 至約 10 g 的施用率處理營養繁殖單元(例如：插枝及塊莖)時，通常可以保護營養繁殖單元。熟習該項技術者可藉由簡單實驗來迅速決定組分(a)及其混合物或組成物(其根據此發明含有所需活性成分

之特定組成物)之施用率，以提供所欲之植物保護與植物病害以及選擇性地其他植物害蟲防治範圍。

式 1 化合物、其 *N*-氧化物及其鹽係對於防治由真菌類病原體造成之植物病害特別有效者，特別是在擔子菌綱(Basidiomycete)與子囊菌綱(Ascomycete)中之真菌類病原體。組合這些化合物與其它殺真菌化合物能防治由擔子菌綱、子囊菌綱、卵菌綱及不完全菌綱中廣泛範圍真菌類植物病原體所引起的病害。因此，本文中所述之混合物或組成物能防治廣泛範圍的植物病害與作物的葉片病原體，作物包括：穀類作物如小麥、大麥、燕麥、黑麥、黑小麥、稻米、玉米、高粱及小米；藤本作物如食用葡萄及酒用葡萄；田間作物如油菜(芥花)、向日葵；甜菜、甘蔗、黃豆、花生(落花生)、菸草、紫花苜蓿(alfafa)、苜蓿、胡枝子、三葉草(trefoil)及大巢菜(vetch)；梨果如蘋果、梨、野蘋果(crabapple)、枇杷(loquat)、山楂(mayhaw)及榲桲(quince)；核果如桃子、櫻桃、梅子、杏、油桃及杏仁(almond)；柑橘類水果如檸檬、萊姆、甜橙、葡萄柚、柑(紅橘)及金桔；根莖類蔬菜以及田間作物(及其葉子)，如朝鮮薊、根甜菜及甜菜、胡蘿蔔、木薯、薑、人參、山葵、防風、馬鈴薯、蘿蔔、蕪菁甘藍、番薯、蕪菁及山藥(yam)；球莖類蔬菜，如大蒜、韭菜、洋蔥及青蔥；葉菜類蔬菜，如芝麻菜(arugula (roquette))、芹菜、水芹、菊苣(苦苣)、茴香、結球萵苣及葉萵苣、香芹、紫萵苣、紅包生菜(red chicory)、大黃、菠菜及紅頭菜；十字花科(芸苔)葉菜類，如青花菜、青花菜葉(苦油菜(rapini))、球芽甘藍(Brussels

sprout)、甘藍菜、小白菜、花椰菜、羽衣甘藍、芥藍、球莖甘藍、芥菜與青菜(greens)；豆科蔬菜(新鮮或乾燥)，如羽扇豆(lupin)、豆類(*Phaseolus* spp.)(包括菜豆(field bean)、四季豆(kidney bean)、利瑪豆(lima bean)、敏豆(navy bean)、斑豆(pinto bean)、紅花四季豆(runner bean)、帶莢豌豆(snap bean)、寬葉菜豆(tepary bean)與蠟豆(wax bean))、豆類(*Vigna* spp.) (包括紅豆(adzuki bean)、長豇豆(asparagus bean)、黑眼豆(blackeyed pea)、豇豆(catjang)、長豆(Chinese longbean)、牛豆(cowpea)、紅小豆(crowder pea)、蛾豆(moth bean)、綠豆(mung bean)、米豆(rice bean)、南方豆(southern pea)、黑綠豆(urd bean)與長豇豆(yardlong bean))、蠶豆(fava)、chickpea (garbanzo)、瓜爾豆(guar)、大豆(jackbean)、鵲豆(lablab bean)、扁豆(lentil)與豌豆(pea) (*Pisum* spp.)(包括豆苗(dwarf pea)、軟莢豌豆(edible-podded pea)、英國豆(English pea)、紫花豌豆(field pea)、豌豆(garden pea)、青豆(green pea)、雪豆(snowpea)、蜜糖豆(sugar snap pea)、樹豆(pigeon pea)與黃豆(soybean))；水果類蔬菜，如茄子(eggplant)、酸漿(groundcherry) (*Physalis* spp.)、香瓜茄(pepino)與番椒(pepper)(包括青椒(bell pepper)、辣椒(chili pepper)、料理用番椒(cooking pepper)、甘椒(pimento)、甜椒(sweet pepper)；綠番茄(tomatillo)及番茄(tomato)；瓜類蔬菜，如佛手瓜(Chayote)(果實)、冬瓜(Chinese waxgourd) (Chinese preserving melon)、醃菜用西瓜(citron melon)、黃瓜(cucumber)、胡瓜(gherkin)、可食用的葫蘆科植物(edible gourd)(包括葫蘆(hyotan)、

南瓜(cucuzza)、絲瓜(hechima)及十角絲瓜(Chinese okra)、苦瓜屬(*Momordica* spp.)(包括苦瓜(balsam apple)、苦瓜(balsam pear)、苦瓜(bittermelon)及小黃瓜(Chinese cucumber)、網紋甜瓜(muskmelon)(包括洋香瓜(cantaloupe)及南瓜(pumpkin))、南瓜(summer and winter squash)(包括奶油瓜(butternut squash)、南瓜(calabaza)、筍瓜(hubbard squash)、橡果形南瓜(acorn squash)、義大利麵瓜(spaghetti squash))以及西瓜(watermelon)；漿果，如黑莓(blackberry)(包括賓格爾莓(bingleberry)、波伊森莓(boysenberry)、露珠莓(dewberry)、羅甘梅(lowberry)、紫藍莓(marionberry)、俄勒岡常綠莓(olallieberry)及楊氏草莓(youngberry))、藍莓(blueberry)、蔓越莓(cranberry)、穗醋栗(currant)、接骨木果實(elderberry)、醋栗(gooseberry)、越橘果(huckleberry)、羅甘梅(loganberry)、覆盆子(raspberry)以及草莓(strawberry)；堅果如杏仁(almond)、山毛櫸堅果(beech nut)、巴西栗子(Brazil nut)、白胡桃(butternut)、腰果(cashew)、栗實(chestnut)、毛枝栗(chinquapin)、大榛子(filbert)(榛(hazelnut))、山核桃(hickory nut)、澳洲胡桃(macadamia nut)、胡桃(pecan)及胡桃(walnut)；熱帶果樹與其他作物，如香蕉(banana)、巴氏蕉(plantain)、芒果(mango)、椰子(coconut)、木瓜(papaya)、番石榴(guava)、酪梨(avocado)、荔枝(lichee)、龍舌蘭(agave)、咖啡(coffee)、可可(cacao)、甘蔗(sugar cane)、油棕櫚(oil palm)、芝麻(sesame)、橡膠(rubber)以及香料(spices)；纖維作物，如棉花(cotton)、亞麻(flax)以及麻(hemp)；草坪植物(包括

暖季性(warm-season)及冷季性(cool-season)草坪)，例如小糠草(bentgrass)、肯塔基藍草(Kentucky bluegrass)、奧古斯丁草(St. Augustine grass)、高牛毛草(tall fescue)以及狗牙根草(Bermuda grass)。

這些病原體包括：卵菌類(Oomycetes)，包括疫病菌屬(*Phytophthora*)病原體，如馬鈴薯疫病菌(*Phytophthora infestans*)、大豆疫病菌(*Phytophthora megasperma*)、柑橘疫病菌(*Phytophthora parasitica*)、樟樹疫病菌(*Phytophthora cinnamomi*)與番椒疫病菌(*Phytophthora capsici*)，草苗立枯病菌屬(*Pythium*)病原體如胡瓜猝倒病菌(*Pythium aphanidermatum*)，以及霜霉科(Peronosporaceae)家族中之病原體如葡萄露菌病菌(*Plasmopara viticola*)、小葉菜類露菌病菌(*Peronospora* spp.) (包括菸草露菌病菌(*Peronospora tabacina*)以及白菜露菌(*Peronospora parasitica*))、瓜類露菌病菌(*Pseudoperonospora* spp.)(包括胡瓜露菌(*Pseudoperonospora cubensis*)))以及萵苣露菌(*Bremia lactucae*)；子囊菌綱(Ascomycetes)，包括馬鈴薯葉燒病菌屬(*Alternaria*)病原體如早疫病菌(*Alternaria solani*)與黑斑病菌(*Alternaria brassicae*)，赤枯病菌屬(*Guignardia*)病原體如葡萄黑腐病菌(*Guignardia bidwelli*)，蘋果黑星病菌屬(*Venturia*)病原體如蘋果黑星病菌(*Venturia inaequalis*)，殼針孢屬(*Septoria*)病原體如小麥穎枯病菌(*Septoria nodorum*)與小麥葉斑病菌(*Septoria tritici*)，白粉病害病原體如白粉菌屬(*Blumeria* spp.)(包括布氏白粉菌(*Blumeria graminis*))與白粉病菌屬(*Erysiphe* spp.)(包

括豆類白粉病菌 (*Erysiphe polygoni*)、鉤絲黴菌 (*Uncinula necatur*)、單絲殼白粉菌 (*Sphaerotheca fuligena*)與蘋果白粉病菌 (*Podosphaera leucotricha*)、小麥基腐病菌 (*Pseudocercospora herpotrichoides*)，灰黴屬 (*Botrytis*)病原體如灰黴病菌 (*Botrytis cinerea*)、褐腐病菌 (*Monilinia fructicola*)，核盤菌屬 (*Sclerotinia*)病原體如菌核病菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*)、稻熱病菌 (*Magnaporthe grisea*)、葡萄枝枯病菌 (*Phomopsis viticola*)、麥類胡麻葉枯病菌屬 (*Helminthosporium*)病原體如小麥德氏黴菌 (*Helminthosporium tritici repentis*)、大麥網斑病菌 (*Pyrenophora teres*)，炭疽病病原體如炭疽病菌屬 (*Glomerella*)或棉黑斑病菌屬 (*Colletotrichum* spp.)(例如禾本科炭疽病菌 (*Colletotrichum graminicola*)與西瓜炭疽病菌 (*Colletotrichum orbiculare*)，以及小麥全蝕病菌 (*Gaeumannomyces graminis*)；擔子菌綱 (*Basidiomycetes*)，包括由以下造成之葉鏽病：鏽病菌屬 (*Puccinia* spp.)(例如小麥葉鏽病菌 (*Puccinia recondita*)、小麥條鏽病菌 (*Puccinia striiformis*)、大麥柄鏽病菌 (*Puccinia hordei*)、小麥桿鏽病菌 (*Puccinia graminis*)與花生鏽病菌 (*Puccinia arachidis*)、駝孢鏽病菌 (*Hemileia vastatrix*)與大豆鏽病菌 (*Phakopsora pachyrhizi*)；其他病原體包括馬鈴薯黑痣病菌屬 (*Rhizoctonia* spp.)(例如樹木苗立枯病菌與稻赤色菌核病菌 (*Rhizoctonia solani* and *Rhizoctonia oryzae*))；鐮刀菌屬 (*Fusarium*)病原體如石竹類立枯病菌 (*Fusarium roseum*)、禾穀鐮刀菌 (*Fusarium graminearum*)與尖鐮孢

菌 (*Fusarium oxysporum*)；棉花黃萎病菌 (*Verticillium dahliae*)；白絹菌 (*Sclerotium rolfsii*)；大麥雲紋病菌 (*Rhynchosporium secalis*)；球座尾孢菌 (*Cercosporidium personatum*)、花生尾孢菌 (*Cercospora arachidicola*)與甜菜葉斑病菌 (*Cercospora beticola*)；絮狀蠟盤菌 (*Rutstroemia floccosum*) (亦已知為 *Sclerotinia homoeocarpa*)；以及其他與這些病原體緊密相關的屬與種。一般而言，病原體係指涉病害，並因此在前述詞句中，用語「病原體」亦指由該病原體造成之植物病害。更精確而言，植物病害係由病原體造成。因此，例如白粉病係由白粉病病原體造成之植物病害，葉枯病 (*Septoria disease*)係由葉枯病病原體造成之植物病害，而葉鏽病係由葉鏽病病原體造成之植物病害。某些殺真菌化合物亦具有殺細菌性，因而除了其殺真菌活性外，該些組成物或組合物亦可具有抗細菌活性，例如梨及蘋果火傷病菌 (*Erwinia amylovora*)、黑腐病菌 (*Xanthomonas campestris*)、細菌性斑點病菌 (*Pseudomonas syringae*)，以及其他相關種。

值得注意的是，其中 R^2 為 H 的式 1 之 2,6-經取代苯胺-吡唑化合物 (即式 1，但其中 X 為 NH，且 R^1 與 R^3 非為 H) 現已發現具有顯著改善之藥物動力學性質，此係相較於對應之化合物 (其中 R^2 非為 H 者)。特別是在脊椎動物中，其中 R^2 為 H 之化合物較非為 H 者已發現其在脂肪中之分布顯著較低，因而減少生物累積的可能性。其中 R^2 為 H 的式 1 之 2,6-經取代苯胺-吡唑化合物，其說明性範例為化合物 239、240、241、244、245、247、

252、253、254、257、258、259、260、261、262、263、264、265、266、267、268、269、270、271、273、275 與 276，如索引表 A 中所載明者。再者，除了在脊椎動物中具有更理想的藥物動力學性質外，式 1 之 2,6-經取代苯胺吡唑化合物(其中 R^1 為鹵素者，或更特定為 Cl 或 Br 者，並且 R^3 為 F 或 Cl 者，或更特定為 F)已發現當 R^2 為 H 時，其對於植物真菌病害仍保有不尋常的高活性，例如由小麥殼針孢葉枯病菌(*Septoria tritici*)造成之植物真菌病害。

式 1 化合物之藥物動力學性質可使用在藥理學上已知的廣泛各式檢測方法來測定。在一種涉及單一經口劑量之說明性方法中，三隻公大鼠與三隻母大鼠係藉由經口胃管灌食法接受單一劑量之測試物質。在即將給藥前經由尾部血管收集約 0.25 mL 的血液，而後在 0.25、0.5、1、2、4、8、12、24 小時及之後每 24 小時收集血液直到犧牲。在犧牲時，亦收集脂肪以測定在犧牲時的脂肪:血漿比例。將血液收集至含有乙二胺四乙酸(EDTA)之試管中並在 $2500 \times g$ 下離心以分離血漿與血球。而後使用例如乙腈與蛋白質沉澱盤(例如 Strata Impact 蛋白質沉澱盤，Phenomenex 料號 CEO-7565, Torrance, CA, U.S.A.)藉由蛋白質沉澱萃取血漿，並遵照針對該盤所提供之指示操作。或者，僅以乙腈萃取血漿，旋渦混合(即使用旋渦混合器加以混合)並離心以團粒化(pellet)蛋白質。在移除蛋白質後，藉由液相層析術-質譜測定法(LC/MS)分析血漿以測定其母化合物與/或代謝物。將脂肪均質化並以有機溶劑如乙腈萃取。而後藉由 LC/MS

分析萃取物以測定其母化合物與/或代謝物。而後使用非線性模擬軟體(例如 WinNonlin™, 來自 Pharsight, Cary, NC, U.S.A.)分析血漿之藥物動力學數據, 以測定在血漿中投予之化合物的半生期、在投予後達到最高血漿濃度的時間($T_{\max}$)、最大血漿濃度($C_{\max}$)與在血漿濃度曲線下的面積(AUC)。由於脂肪分析需要犧牲大鼠, 故僅得到單一時點(即犧牲時)之脂肪數據。然而, 藉由使用多隻大鼠(在投藥時間後的不同時段犧牲), 即可測定大鼠的這些參數如 $C_{\max}$ 。使用上述方法, 索引表中所載明之化合物 239、240 與 241 已發現其在脂肪中之分布顯著較低, 此係相較於其中 R^2 非為 H 之對應化合物。

在本發明的殺真菌組成物中, 組分(a)之式 1 化合物可與額外的組分(b)殺真菌化合物協同作用以提供有益結果, 例如擴大防治的植物病害範圍、延長預防性或治療性保護之持續時間以及抑制抗性真菌類病原體的增生。在特定實施例中, 根據本發明所提供之實施例包含組分(a)與組分(b)比例, 其對於防治特定真菌病害特別有用者(例如早疫病菌(*Alternaria solani*)、布氏白粉菌(*Blumeria graminis* f. sp. *tritici*)、灰黴病菌(*Botrytis cinerea*)、麥葉鏽病菌(*Puccinia recondita* f. sp. *tritici*)、樹木苗立枯病菌(*Rhizoctonia solani*)、小麥穎枯病菌(*Septoria nodorum*)、小麥殼針孢葉枯病(*Septoria tritici*))。

殺真菌劑之混合物基於各組分之活性, 亦可能提供較預測明顯更佳之疾病防治。此種協同效果已描述為「混合物中兩種成分之合作行為, 使總效較此兩種(或

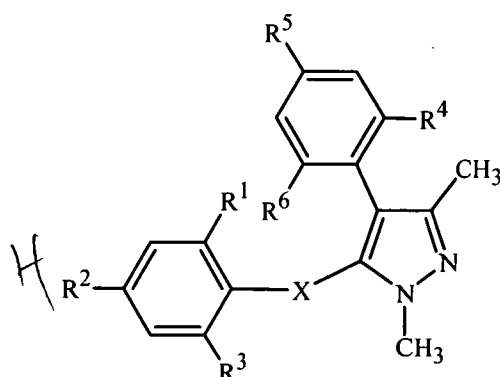
多種)之效果各自發揮之總和更為顯著或持久」(請參見 P. M. L. Tames, *Neth. J. Plant Pathology* **1964**, 70, 73-80)。在提供植物病害防治的方法中，協同效果展現於施予該植物或種子的活性成分組合(例如殺真菌化合物)，該活性成分係以協同性重量比例以及協同性(即，協同性有效的)劑量施用。病害防治、抑制與預防的劑量方式不能超過 100%。因此顯著的協同效果表現典型為需要使用其中活性成分分開提供時遠低於 100%效果之活性成分施用率，因此其加成性效果顯著低於 100%，以使因為協同效果導致效果增加可能性出現。在另一方面，太低之活性成分施用率即使在協同效果的益處下，仍可能無法在混合物中顯示出許多活性。熟習該項技術者可透過簡單實驗迅速鑑別及最佳化提供協同作用之殺真菌化合物的重量比例及施用率(即，量)。

下列測試包括展現本發明化合物用於防治特定病原體之效力的測試；因而包含本發明化合物之殺真菌混合物提供了此效力。下列測試亦包括展現本發明之混合物對於特定病原體之防治效力的測試。然而，本發明之單獨化合物或其混合物所提供之疾病防治並不限於例示之致病真菌物種。

請參見索引表 A 以取得化合物描述。請參見索引表 B 以取得熔點數據。請參見索引表 C 以取得 ^1H NMR 數據。下列縮寫係用於索引表如下：Me 為甲基，MeO 為甲氧基，EtO 為乙氧基，且-CN 為氰基。由於對稱性的關係，若 R^1 、 R^3 、 R^4 與 R^6 的定義許可， R^1 可與 R^3 互換，且 R^4 可 R^6 互換。縮寫「Cmpd.」代表「化合物」，

且縮寫「Ex.」代表「實例」，並且依照指示製備化合物之合成實例的編號編排。質譜(M.S.)係記述為最高同位素豐度母離子(M+1)之分子量，其係藉由將 H^+ (分子量為 1) 加入至該分子而形成，藉由使用大氣壓力化學離子化(AP⁺)的質譜測定法測定。含有一或多個較低豐度之較高原子量同位素(例如 ³⁷Cl、⁸¹Br)的分子離子，其出現並未被記述。

索引表 A



Cmpd No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
1	F	H	H	Cl	F	H	NH	334
2	F	F	H	Cl	F	H	NH	352
3 (Ex. 1)	F	MeO	F	Cl	F	H	NH	**
4	F	F	F	Cl	F	H	NH	370
5	F	MeO	H	Cl	F	H	O	365
6	F	F	H	F	MeO	F	NH	366
7 (Ex. 2)	F	F	F	F	MeO	F	NH	**
8 (Ex. 6)	F	-CN	F	F	F	F	O	**
9	Cl	Cl	H	F	F	F	O	387
10	Cl	Cl	H	F	MeO	F	O	399
11	F	F	F	F	F	H	NH	354

Cmpd No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
12	F	MeO	F	F	F	H	NH	366
13 (Ex. 3)	F	-CN	F	Cl	F	H	O	**
14	F	-CN	F	F	MeO	H	O	374
15	F	Cl	F	F	MeO	F	O	***
16	F	MeO	F	Cl	Cl	H	NH	398
17 (Ex. 4)	F	F	H	Cl	Cl	H	NH	**
18	F	F	F	Cl	Cl	H	NH	386
19	F	MeO	F	F	F	F	NH	384
20	F	-CN	F	F	MeO	F	NH	391
21	F	MeO	F	F	MeO	F	NH	396
22	F	H	F	F	MeO	F	O	367
23	Cl	F	H	F	MeO	F	NH	382
24	F	Br	F	F	MeO	F	O	447
25	F	-CN	F	Cl	F	H	NH	377
26	F	-CN	F	F	F	F	NH	379
27	F	-CN	H	F	F	F	O	362
28	Cl	-CN	H	F	F	F	O	378
29	F	F	F	Cl	MeO	H	NH	382
30	F	F	H	F	-CN	F	NH	361
31	Cl	F	H	F	-CN	F	NH	*
32	Cl	-CN	H	F	MeO	F	NH	389
33	F	-CN	H	Cl	F	H	O	360
34	F	-CN	H	F	F	F	NH	361
35	F	F	F	F	-CN	F	NH	*
36	F	MeO	F	F	-CN	F	NH	*
37	Cl	-CN	H	Cl	F	H	O	376
38	F	-CN	F	F	MeO	F	O	392
39	F	F	H	F	EtO	F	NH	380
40	F	Cl	H	F	-CN	F	NH	*
41	F	-CN	F	Cl	MeO	H	O	390
42	F	F	H	Cl	MeO	H	NH	364
43	F	H	F	Cl	MeO	H	NH	364

Cmpd No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
44	Cl	-CN	H	Cl	F	H	NH	375
45	F	-CN	F	F	F	H	O	362
46	F	H	F	Cl	F	H	NH	352
47	Cl	F	H	Cl	F	H	NH	368
48	F	F	H	Cl	H	F	NH	352
49	F	F	H	F	H	F	NH	*
50	Cl	Cl	H	F	H	F	NH	*
51	F	MeO	H	F	H	F	NH	*
52	F	F	H	F	H	H	NH	318
53	F	F	F	F	H	H	NH	336
54	F	MeO	F	F	H	H	NH	348
55	F	MeO	F	Cl	H	F	NH	382
56	F	F	F	Cl	H	F	NH	369
57	F	-CN	F	Cl	H	F	NH	377
58	Cl	F	H	Cl	H	F	NH	368
59	F	-CN	H	F	H	F	NH	343
60	Cl	MeO	H	F	H	F	NH	*
61	Cl	F	H	F	F	H	NH	*
62	F	F	H	F	MeO	F	CHOH	381
63	F	MeO	H	F	F	H	NH	*
64	F	F	H	F	F	H	NH	336
65	F	-CN	F	Br	F	H	O	423
66	Cl	MeO	H	F	F	H	NH	*
67	Cl	Cl	H	F	F	H	NH	*
68	F	-CN	H	F	F	H	NH	*
69	F	H	F	F	H	F	NH	*
70	F	F	F	Br	H	H	NH	398
71	F	H	F	F	F	H	NH	*
72	F	MeO	F	F	H	F	NH	*
73	Br	F	H	Cl	F	H	NH	413
74	F	F	F	Br	F	H	NH	415
75	F	-CN	F	Cl	H	H	O	*

104 年 6 月 8 日修正替換頁

Cmpd No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
76	F	-CN	F	Br	H	H	O	*
77	Cl	Cl	H	Cl	MeO	H	NH	397
78	Cl	Cl	H	Cl	H	F	NH	386
79	F	-CN	H	Br	F	H	O	406
80	Cl	-CN	H	Br	F	H	O	422
81	F	Cl	F	Cl	F	H	NH	386
82	Cl	F	F	Cl	F	H	NH	386
83	F	-CN	F	F	F	H	NH	*
84	Cl	F	F	Br	F	H	NH	431
85	Cl	MeO	Cl	Cl	F	H	NH	413
86	Cl	F	F	F	H	F	NH	370
87	Cl	F	F	Cl	H	F	NH	386
88	Cl	Cl	H	Cl	F	H	NH	383
89	F	F	F	F	H	F	NH	*
90	F	-CN	F	F	H	F	NH	*
91	F	-CN	F	F	H	H	O	*
92	F	-CN	H	Cl	MeO	H	O	372
93	Cl	-CN	H	Cl	MeO	H	O	388
94	F	F	H	Br	F	H	NH	398
95	Br	F	H	Br	F	H	NH	458
96	Cl	F	H	Br	F	H	NH	414
97	F	F	H	Cl	H	H	NH	334
98	Cl	F	Cl	Br	F	H	NH	448
99	Cl	-CN	H	Br	MeO	H	O	433
100	F	-CN	H	Br	MeO	H	O	418
101	Cl	MeO	H	Cl	F	H	NH	380
102	Cl	MeO	Cl	Br	F	H	NH	459
103	Cl	MeO	H	Br	F	H	NH	425
104	Cl	EtO	H	Cl	F	H	NH	394
105	Cl	Cl	H	Cl	H	Cl	NH	*
106	F	-CN	F	Cl	F	F	NH	395
107	F	F	H	Cl	-CN	H	NH	359

Cmpd No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
108	Cl	F	F	Cl	-CN	H	NH	393
109	Cl	F	H	Cl	H	Cl	NH	*
110	F	H	F	Cl	-CN	H	NH	359
111	F	Cl	F	Cl	-CN	H	NH	393
112	Cl	F	H	Cl	-CN	H	NH	375
113	F	F	H	Cl	H	Cl	NH	*
114	Br	F	H	Cl	H	Cl	NH	*
115	Cl	F	Cl	Cl	H	Cl	NH	*
116	F	-CN	H	Cl	H	F	O	360
117	Cl	F	F	F	F	H	NH	369
118	Br	F	H	F	F	H	NH	398
119	F	-CN	H	F	Cl	H	O	360
120	Br	F	Cl	F	F	H	NH	432
121	F	Cl	F	F	H	F	NH	370
122 (Ex. 5)	F	F	H	Cl	F	H	CHOH	**
123	Cl	F	H	Cl	F	H	CHOH	383
124	F	H	F	Cl	Cl	H	NH	*
125	Cl	F	H	Cl	Cl	H	NH	*
126	F	Cl	F	F	F	H	NH	370
127	Cl	-CN	H	F	H	F	O	360
128	F	-CN	H	F	F	H	O	376
129	F	Cl	F	Br	F	H	NH	432
130	F	-CN	H	F	H	F	O	344
131	Cl	-CN	H	Cl	Cl	H	O	394
132	Cl	F	Cl	Cl	Cl	H	NH	*
133	F	Br	F	F	F	H	NH	416
134	F	Br	F	Cl	F	H	NH	432
135	F	Br	H	Cl	F	H	NH	414
136	Cl	Cl	F	Cl	F	H	NH	402
137	Cl	F	Cl	F	F	H	NH	386
138	Cl	F	Cl	Cl	F	H	NH	404
139	Br	-CN	H	F	F	H	O	406

104 年 6 月 8 日修正替換頁

Cmpd No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
140	Cl	-CN	H	F	F	H	O	360
141	Cl	Cl	F	F	F	H	NH	386
142	Cl	F	Cl	F	H	F	NH	386
143	Br	F	F	F	F	H	NH	416
144	Br	F	F	Cl	F	H	NH	432
145	F	Br	F	F	H	F	NH	416
146	Br	F	F	F	H	F	NH	416
147	Br	F	F	Cl	H	F	NH	
148	F	Cl	F	Cl	F	H	CHOH	401 ‡
150	F	Cl	F	F	-CN	H	NH	377
151	Cl	F	F	Cl	F	H	CHOH	
152	Br	F	H	F	F	H	CHOH	
153	Br	F	H	Cl	F	H	CHOH	427 †
154	F	Br	H	F	F	H	NH	396
155	Cl	Br	Cl	F	F	H	NH	448
156	Cl	F	F	Cl	Cl	H	NH	*
157	F	Cl	F	Cl	Cl	H	NH	*
158	F	Cl	H	Cl	F	H	O	369
159	F	-CN	H	F	F	H	O	344
160	F	Cl	H	F	F	H	NH	352
161	Cl	Cl	F	F	F	H	NH	386
162	F	Cl	H	F	H	F	NH	352
163	F	Br	F	Br	F	H	NH	474
164	Cl	Br	Cl	Cl	F	H	NH	464
165	Cl	Cl	Cl	F	F	H	NH	404
167	Cl	Br	H	F	F	H	NH	414
168	Cl	Br	Cl	Br	F	H	NH	508
169	F	Br	H	Br	F	H	NH	458
170	Cl	Cl	Cl	Cl	F	H	NH	420
172	Cl	Br	H	Cl	F	H	NH	430
173	Cl	Br	H	Br	F	H	NH	474
174	Cl	Cl	Cl	Br	F	H	NH	464

Cmpd No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
175	I	F	H	F	F	H	NH	444
177	F	Cl	H	Cl	F	H	CHOH	384
178	F	F	F	Cl	F	H	CHOH	385
179	F	-CN	H	Cl	F	H	CHOH	374
180	F	Cl	I	F	F	H	NH	478
181	I	F	H	Cl	F	H	NH	460
182	F	Cl	I	Cl	F	H	NH	494
183	Br	Br	H	Cl	F	H	NH	474
184	Br	Br	H	F	F	H	NH	458
185	F	Cl	F	F	MeO	H	NH	382
186	F	Cl	Br	Cl	F	H	NH	448
187	F	F	Cl	F	MeO	H	NH	396
188	F	F	Cl	F	EtO	H	NH	396
189	F	Cl	F	F	EtO	H	NH	396
190	F	Cl	Cl	F	EtO	H	NH	412
191	F	Cl	Cl	F	MeO	H	NH	398
192	Cl	F	Cl	F	EtO	H	NH	412
193	F	F	H	F	EtO	H	NH	***
194	Cl	F	Cl	F	MeO	H	NH	398
195	Br	F	F	Br	F	H	NH	476
196	F	F	Cl	F	EtO	F	NH	414
197	Cl	Cl	I	Cl	F	H	NH	512
198	Cl	Cl	F	F	EtO	F	NH	430
199	F	Cl	F	F	EtO	F	NH	414
200	Cl	F	Cl	F	EtO	F	NH	430
201	F	Cl	Cl	Cl	MeO	H	NH	416
202	F	Cl	Cl	Cl	EtO	H	NH	430
203	F	F	Cl	Cl	MeO	H	NH	398
204	F	Cl	F	Cl	MeO	H	NH	398
205	Cl	F	Cl	Cl	MeO	H	NH	416
206	F	F	Cl	Cl	EtO	H	NH	412
207	F	Cl	F	Cl	EtO	H	NH	412

104 年 6 月 8 日修正替換頁

Cmpd No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
208	Cl	F	Cl	Cl	EtO	H	NH	430
209	F	F	H	Cl	EtO	H	NH	378
210	Cl	Cl	I	F	F	H	NH	494
211	Br	Br	F	F	F	H	NH	476
212	Br	Br	F	Cl	F	H	NH	492
213	F	F	I	Cl	F	H	NH	478
214	F	F	I	F	F	H	NH	462
215	F	F	I	Br	F	H	NH	524
216	F	I	F	F	F	H	NH	462
217	F	I	F	Cl	F	H	NH	478
218	F	I	F	Br	F	H	NH	524
219	I	F	F	Cl	MeO	H	NH	490
220	F	I	F	Cl	MeO	H	NH	490
221	F	F	Br	Cl	MeO	H	NH	444
222	Cl	Cl	F	I	F	H	NH	494
223	Br	Br	F	I	F	H	NH	584
224	F	Cl	F	Cl	MeO	H	CHOH	413
225	F	Cl	F	I	F	H	NH	478
226	Br	F	F	I	F	H	NH	524
227	Cl	F	Cl	F	Cl	H	NH	*
228	Cl	F	F	F	Cl	H	NH	*
229	Br	F	F	F	Cl	H	NH	*
230	F	Cl	F	F	Cl	H	NH	*
231	F	Cl	Cl	F	Cl	H	NH	*
232	Cl	F	H	F	Br	H	NH	*
233	Cl	F	Cl	F	Br	H	NH	*
234	Cl	F	F	F	Br	H	NH	*
235	Br	F	F	F	Br	H	NH	*
236	F	Cl	F	F	Br	H	NH	*
237	F	Cl	Cl	F	Br	H	NH	*
238	Cl	F	F	F	-CN	H	NH	*
239	Cl	H	F	Cl	F	H	NH	*

Cmpd No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
240 (Ex. 7)	Cl	H	F	Br	F	H	NH	414
241	Br	H	F	Cl	F	H	NH	414
242	Br	H	H	Br	F	H	NH	440
243	I	H	H	Br	F	H	NH	488
244	Br	H	F	Br	F	H	NH	*
245	Br	H	F	F	F	H	NH	*
246	I	H	H	F	F	H	NH	426
247	Br	H	F	F	H	F	NH	*
248	Cl	F	H	F	-CN	H	NH	***
249	Cl	F	Cl	F	-CN	H	NH	*
250	-CN	F	F	F	-CN	H	NH	*
251	Cl	H	Cl	F	F	H	NH	367
252	Me	H	F	Cl	F	H	NH	348
253	Me	H	Cl	Cl	F	H	NH	364
254	Me	H	Br	Cl	F	H	NH	410
255	Cl	H	Cl	Cl	F	H	NH	*
256	Cl	H	Cl	Br	F	H	NH	*
257	Me	H	Cl	F	MeO	H	NH	360
258	Me	H	Br	F	MeO	H	NH	406
259	Me	H	F	F	MeO	H	NH	344
260	Cl	H	F	F	MeO	H	NH	364
261	Br	H	F	F	MeO	H	NH	410
262	Me	H	Cl	Cl	MeO	H	NH	376
263	Me	H	Br	Cl	MeO	H	NH	422
264	Cl	H	F	Cl	MeO	H	NH	380
265	Me	H	Br	F	F	H	NH	394
266	Me	H	Br	Br	F	H	NH	454
267	Me	H	F	Br	F	H	NH	394
268	Me	H	F	F	F	H	NH	332
269	Me	H	Cl	F	F	H	NH	348
270	Me	H	Me	F	F	H	NH	328
271	Me	H	Me	Cl	F	H	NH	344

104 年 6 月 8 日修正替換頁

Cmpd No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
272	Cl	H	H	Br	F	H	NH	396
273	Br	H	F	Cl	MeO	H	NH	426
274	Br	H	H	Cl	F	H	NH	396
275	Cl	H	F	F	F	H	NH	352
276	Me	H	Cl	Br	F	H	NH	410

* 熔點(MP)數據係列示於索引表 B 中。

** AP⁺數據或 ¹H NMR 數據係列示於合成實例中。

*** ¹H NMR 數據係列示於索引表 C 中。

† 觀測得母離子(M)峰而非 M+1 峰。

‡ 亦觀測得 402 (M+2)峰。

索引表 B

Cmpd No.	熔點 ^a	Cmpd No.	熔點	Cmpd No.	熔點
31	80–82	72	172–174	156	181–183
35	160–162	75	132–135	157	155–157
36	228–230	76	132–134	227	183–184
40	93–95	83	181–183	228	180–182
49	110–112	89	178–180	229	154–155
50	105–107	90	168–170	230	190–191
51	130–132	91	101–105	231	154–155
60	109–111	114	137–139	238	177–179
61	57–59	115	151–153	239	166–168
63	133–135	124	169–171	244	154–156
66	91–93	125	111–113	245	149–151
67	82–84	132	229–231	247	127–129
68	182–184	232	88–89	249	200–202
69	156–158	233	186–187	250	200–202
71	171–173	234	182–183	255	183–185
105	118–120	235	167–169	256	199–201
109	117–119	236	199–201		
113	135–136	237	160–162		

^a 熔點數據為℃。

索引表 C

Cmpd No.	¹ H NMR 數據(除非另有指明，否則均指 CDCl ₃ 溶液) ^a
15	δ 6.74 (m, 2H), 6.30 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 2.03 (s, 3H)。
193	δ 7.01 (m, 1 H) 6.79 (ddd, 1H) 6.63 (m, 3 H) 6.34 (td, 1H) 5.34 (br s, 1H) 3.99 (m, 2H) 3.68 (s, 3H) 2.23 (s, 3H) 1.39 (m, 3H)。
248	δ 7.30 (m, 2H), 7.25–7.30 (m, 1H), 7.08 (m, 1H), 6.76 (m, 1H), 6.28 (m, 1H), 5.67 (br s, 1H), 3.69 (s, 3H), 2.27 (s, 3H)。

^a ¹H NMR 數據係偏離自四甲基矽烷的低場 ppm。偶合係以下列標示：

(s)-單峰，(br s)-寬單峰，(ddd)-雙重峰的雙重峰的雙重峰，(td)-雙重峰的三重峰與(m)-多重峰。

本發明之生物實例

製備用於測試 A–I 之測試懸浮液的通用方法：先將測試化合物以相當於最終體積 3% 的量溶於丙酮，接著以所欲濃度(單位為 ppm)懸浮在含 250 ppm 表面活性劑 Trem[®] 014(多元醇酯)之丙酮和純水(以 50/50 體積混合)中。而後將所得測試懸浮液用於測試 A–I 中。每個測試為三重複測試，而結果為平均值。噴灑一 200 ppm 的測試懸浮液於測試植物上直到溢流程度，其相當於約 800 g/ha 的施用率。除非另有指明，評值指出使用 200 ppm 測試懸浮液。(評值旁的星號「*」代表使用 40 ppm 測試懸浮液。)

試驗 A

將測試懸浮液噴灑於番茄苗至溢流為止。於第二天將灰黴病菌(*Botrytis cinerea*)(番茄灰黴病的致病劑)孢子懸浮液接種於幼苗，於 20°C 飽和蒸氣壓下培養 48 小時，接著移至 24°C 生長箱中再置 3 天，在此時間後，進行外觀疾病評級。

試驗 B

將測試懸浮液噴灑於番茄苗至溢流為止。於第二天將早疫病菌(*Alternaria solani*)(番茄早疫病的致病劑)孢子懸浮液接種於植苗，於 27°C 飽和蒸氣壓下培養 48 小時，接著移至 20°C 生長箱中放置 5 天，在此時間後，進行外觀疾病評級。

試驗 C

將測試懸浮液噴灑於番茄苗至溢流為止。於第二天將疫病菌(*Phytophthora infestans*)(番茄疫病的致病劑)孢子懸浮液接種於植苗，於 20°C 飽和蒸氣壓下培養 24 小時，接著移至 20°C 生長箱中放置 5 天，在此時間後，進行外觀疾病評級。

試驗 D

將測試懸浮液噴灑於匍伏翦股草幼苗(*creeping bent grass*)(*Agrostis* sp.)至溢流為止。於第二天將立枯絲核菌(*Rhizoctonia solani*)(草坪褐斑病的致病劑)的麩和菌絲體漿液接種於幼苗，於 27°C 飽和蒸氣壓下培養 48

小時，接著移至 27°C 生長箱中放置 3 天，在此時間後，進行外觀疾病評級。

試驗 E

將測試懸浮液噴灑於小麥苗至溢流為止。於第二天將麥穎枯病菌(*Septoria nodorum*)(麥穎枯病的致病劑)孢子懸浮液接種於幼苗，於 24°C 飽和蒸氣壓下培養 48 小時，接著移至 20°C 生長箱中放置 9 天，在此時間後，進行外觀疾病評級。

試驗 F

將測試懸浮液噴灑於小麥苗至溢流為止。於第二天將小麥殼針孢葉枯病菌(*Septoria nodorum*)(小麥葉斑病的致病劑)孢子懸浮液接種於幼苗，於 24°C 飽和蒸氣壓下培養 48 小時，接著移至 20°C 生長箱中放置額外 19 天，在此時間後，進行外觀疾病評級。

試驗 G

將小麥葉鏽病菌(*Puccinia recondita* f. sp. *tritici*)(小麥葉鏽病的致病劑)孢子懸浮液接種於小麥苗，於 20°C 飽和蒸氣壓下培養 24 小時，接著移至 20°C 生長箱中放置 2 天。此時間結束時，將測試懸浮液噴灑至溢流為止，接著將該幼苗移至 20°C 生長箱中放置 4 天，在此時間後，進行外觀疾病評級。

試驗 H

將測試懸浮液噴灑於小麥苗至溢流為止。於第二天將小麥葉鏽病菌(*Puccinia recondita* f. sp. *tritici*)(小麥葉鏽病的致病劑)孢子懸浮液接種於幼苗，於 20°C 飽和蒸氣壓下培養 24 小時，接著移至 20°C 生長箱中放置 6 天，在此時間後，進行外觀疾病評級。

試驗 I

將測試懸浮液噴灑於小麥苗至溢流為止。於第二天將小麥白粉病(*Blumeria graminis* f. sp. *tritici*)(亦已知為 *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*，小麥白粉病之致病劑)孢子粉接種於幼苗，於 20°C 生長箱中培養 8 天，在此時間後，進行外觀疾病評級。

測試 A–I 之結果係示於表 A 中。表中，等級 100 表示 100% 疾病防治，而等級 0 表示無疾病防治效果(相對於對照組)。連號(-)代表無測試結果。

表 A

Cmpd No.	測試 A	測試 B	測試 C	測試 D	測試 E	測試 F	測試 G	測試 H	測試 I
1	99	93	0	99	0	100	-	99	100
2	99	100	0	98	64	100	-	100	99
3	100	100	-	-	93	97	96	100	100
4	99	100	-	-	99	95	99	100	100
5	98	100	-	-	97	97*	-	100	99
6	98	100	-	-	99	93	92	100	100
7	98	100	-	-	0	94	9	97	100
8	99*	98*	-	-	0*	47*	15*	79*	60*
9	99	9	-	-	0	97	0	99	99
10	99	0	-	-	0	94	92	99	99
11	100	99	-	-	90	94	0	100	99

Cmpd No.	測試 A	測試 B	測試 C	測試 D	測試 E	測試 F	測試 G	測試 H	測試 I
12	100	0	-	-	0	93	0	94	82
13	100	100	-	-	100	100	7	100	100
14	99	100	-	-	99	100	37	100	99
15	98	100	-	-	89	98	82	100	100
16	99	98	-	-	84	98	98	99	99
17	100	73	-	-	60	99	91	99	100
18	100	98	-	-	98	99	95	99	97
19	99	82	-	-	0	98	0	89	91
20	100	100	-	-	40	99	0	68	13
21	100	100	-	-	89	99	99	96	94
22	100	100	-	-	78	100	98	100	99
23	100	100	-	-	95	98	85	99	100
24	99	95	-	-	84	100	0	98	100
25	100	99	-	-	95	99	0	100	100
26	100	100	-	-	99	100	41	99	100
27	99	99	-	-	99	100	9	99	100
28	100	17	-	-	69	100	26	99	99
29	100	99	-	-	97	99	99	99	100
30	100	99	-	-	90	100	82	99	100
31	100	98	-	-	99	99	53	100	100
32	99	97	-	-	82	100	11	98	97
33	100	100	-	-	98	100	99	100	99
34	100	99	9	-	94	100	0	99	99
35	100	100	-	-	60	99	0	100	94
36	99	0	-	-	0	99	0	41	0
37	100	86	-	-	100	100	69	99	100
38	99	94	-	-	87	99	0	96	97
39	99	99	-	-	98	100	0	99	100
40	99	99	-	-	100	100	63	100	100
41	100	99	-	-	100	100	92	100	99
42	98	99	-	-	0	99	8	100	100
43	98	100	-	-	0	100	95	100	98
44	99	0	-	-	0	99	8	98	94
45	100	99	0	-	99	98	0	100	99
46	100	100	-	-	87	100	0	99	100

104 年 6 月 8 日修正替換頁

Cmpd No.	測試 A	測試 B	測試 C	測試 D	測試 E	測試 F	測試 G	測試 H	測試 I
47	100	99	0	-	82	96	93	99	100
48	100	100	-	-	73	98	0	83	100
49	100	100	-	-	80	98	0	83	100
50	100	99	-	-	73	95	0	93	100
51	100	99	-	-	0	98	0	68	100
52	94	44	-	-	0	100	0	60	98
53	97	99	-	-	87	100	0	95	99
54	97	100	-	-	67	99	27	94	99
55	99	99	-	-	80	100	94	100	99
56	98	100	-	-	0	100	0	97	99
57	97	100	-	-	73	100	0	99	99
58	99	100	-	-	0	100	32	99	100
59	99	94	0	-	73	100	9	98	98
60	99	97	-	-	20	100	18	97	99
61	100	93	-	-	64	100	0	99	100
62	100	100	-	-	99	100	0	99	99
63	99	99	-	-	0	99	0	80	99
64	99	99	-	-	0	100	0	97	100
65	100	99	-	-	99	100	0	100	100
66	99	37	-	-	0	100	0	91	100
67	100	64	-	-	0	100	0	97	100
68	99	51	-	-	0	100	0	80	100
69	100	99	-	-	60	100	0	99	100
70	99	26	-	-	73	100	0	99	100
71	99	99	-	-	96	100	0	99	100
72	100	99	-	-	0	100	0	97	98
73	100	99	-	-	78	100	90	100	100
74	100	100	-	-	98	100	0	100	100
75	100	99	-	-	99	100	0	99	98
76	100	97	-	-	99	99	0	99	99
77	99	98	-	-	0	99*	0	99	100
78	99	65	-	-	0	99*	9	99	100
79	99	99	-	-	100	100*	28	100	100
80	98	0	-	-	60	100*	9	99	99
81	100	99	0	-	90	100	99	100	100

Cmpd No.	測試 A	測試 B	測試 C	測試 D	測試 E	測試 F	測試 G	測試 H	測試 I
82	99	100	0	-	100	100	97	100	100
83	100	99	-	-	87	100	0	100	100
84	100	99	-	-	96	100	92	100	100
85	99	0	-	-	0	100	0	99	99*
86	100	99	-	-	90	100	0	100	100
87	100	93	-	-	87	100	0	100	100
88	100	95	-	-	51	100*	41	100	100
89	100	99	-	-	82	100	9	99	100
90	99	87	-	-	87	100	0	98	99
91	99	99	-	-	94	100	0	99	99
92	100	99	-	-	99	100	0	99	96
93	100	0	-	-	60	100	0	99	91
95	100	97	-	-	51	100	91	100	100
96	100	95	-	-	0	100	94	100	100
97	99	99	-	-	0	100	0	96	100
98	99	0	-	-	0	99	9	99	96
99	99	0	-	-	0	100	0	97	89
100	92	88	-	-	100	100	0	99	95
101	100	93	-	-	0	100	99	100	100
102	98	0	-	-	0	98	0	94	95*
103	99	83	-	-	0	100	63	99	99
104	100	0	-	-	0	100	0	97	99
105	99	0	-	-	0	100	0	96	99
107	100	80	-	-	73	100	8	100	97
109	100	0	-	-	0	100	0	97	100
111	100	97	-	-	95	100	94	100	99
112	100	37	-	-	40	100	8	100	99
113	100	0	-	-	0	100	0	98	100
114	99	0	-	-	0	100	0	91	100
115	99	0	-	-	0	99	0	99	93
116	100	33	-	-	99	100	0	100	100
117	100	100	-	-	97	100	91	100	100
118	100	93	-	-	69	100	75	97	100
119	99	94	-	-	94	100	0	91	99
120	100	80	-	-	94	100	19	100	100

104 年 6 月 8 日修正替換頁

Cmpd No.	測試 A	測試 B	測試 C	測試 D	測試 E	測試 F	測試 G	測試 H	測試 I
122	100	99	-	-	92	100	96	100	99
123	100	86	-	-	60	100	6	100	95
124	97	17	-	-	0	99	3	99	99
125	99	0	-	-	0	100	82	98	100
126	100	86	-	-	87	100	0	99	100
127	99	0	-	-	0	100	0	97	97
128	100	99	-	-	97	100	0	100	99
129	100	97	-	-	95	100	79	100	100
130	100	90	-	-	0	100	0	100	100
131	100	0	-	-	0	100	0	96	96
132	93 (註解 1)	0	-	-	0	99	0	96	43
133	99	97	-	-	88	100	0	99	100
134	100	99	-	-	64	100	74	100	100
135	100	58	-	-	0	100	9	99	100
136	100	100	0	-	100	100	100	100	100
137	100	95	-	-	87	100	87	99	100
138	100	66	0	-	0	100	17	100	99
139	82	0	-	-	0	100	9	89	0
140	67	0	-	-	0	100	9	97	97
141	99	99	-	-	99	100	97	100	100
142	100	96	0	-	92	100	0	100	100
143	100	100	0	-	100	100	100	100	100
144	100	99	-	-	100	100	100	100	100
145	99	0	0	-	0	100	0	28	90
146	-	100	0	-	100	100	74	98	100
148	100	0	-	-	60	100	0	100	64
150	100	-	-	-	-	100	-	100	100
153	-	0	-	-	0	100	0	96	0
154	100	9	-	-	0	100	68	98	99
155	100	0	-	-	0	100	94	97	99
156	100	99	-	-	73	100	31	99	99
157	100	97	0	-	87	100	27	100	99
158	100*	80*	-	-	0*	99*	37*	98*	96*
159	100*	97*	-	-	86*	100*	0*	98*	96*
160	100	99	-	-	0	100	0	99	100

Cmpd No.	測試 A	測試 B	測試 C	測試 D	測試 E	測試 F	測試 G	測試 H	測試 I
161	100	99	0	-	100	99	100	100	100
162	100	88	0	-	0	100	9	100	100
163	100*	77*	-	-	60*	100*	91*	100*	100*
164	99	0	-	-	0	100	99	100	99
165	100	0	0	-	0	100	67	99	99
167	100	0	-	-	0	100	6	92	98
168	0	0	-	-	0	100	97	91	48
169	100	0	-	-	60	100	23	96	99
170	65	0	-	-	0	100	79	98	79
172	100	73	-	-	60	100	0	100	100
173	100	0	-	-	40	100	0	99	99
174	95	0	-	-	0	100	0	99	99*
175	100	97	-	-	73	100	41	100	100
177	99	0	-	-	0	-	0	0	48
178	100	33	-	-	0	-	98	100	74
179	96	16	-	-	0	-	9	99	0
180	100	100	9	-	99	100	98	100	100
181	100	99	-	-	99	100	99	99	100
182	100	100	-	-	100	100	100	100	100
183	100	0	-	-	0	100	54	96	98
184	100	58	-	-	60	100	0	98	100
185	100	99	0	-	60	100	0	99	100
186	100	100	0	-	100	100	100	100	100
187	100	100	0	-	89	-	32	100	100
188	100	99	0	-	92	-	0	98	98
189	100	88	0	-	90	-	0	98	98
190	100	82	0	-	0	-	9	96	95
191	100	99	0	-	92	-	46	99	99
192	33	66	0	-	0	100	0	65	35
193	-	58	-	-	0	100	0	27	92
194	-	93	-	-	87	100	0	95	63
195	99	100	0	-	99	100	89	100	100
196	100	100	0	-	95	100	0	94	100
197	100	77	-	-	0	100	9	97	94
198	100	100	-	-	60	100	9	80	96

Cmpd No.	測試 A	測試 B	測試 C	測試 D	測試 E	測試 F	測試 G	測試 H	測試 I
199	100	100	68	-	69	100	0	83	99
200	98	97	31	-	0	100	0	86	79
201	100	100	-	-	99	100	98	100	97
202	99	77	-	-	0	100	35	92	95
203	95	100	-	-	73	100	79	100	98
204	99	99	-	-	99	100	99	100	100
205	59	31	-	-	0	100	0	99	21
206	99	100	-	-	99	100	0	99	100
207	94	99	-	-	86	100	0	94	99
208	18	0	-	-	0	99	0	85	27
209	98	95	-	-	0	100	0	92	100
210	3	0	-	-	0	100	0	97	0
211	98	99	-	-	99	100	82	100	100
212	98	100	-	-	100	100	97	100	100
213	100	100	-	-	100	100	100	100	100
214	100	100	-	-	99	100	99	99	100
215	100	100	-	-	99	100	100	100	100
216	100	0	-	-	60	100	18	95	99
217	100	58	-	-	86	100	41	99	99
218	100	68	-	-	86	100	0	99	99
219	100	100	-	-	100	100	99	100	99
220	100	69	-	-	73	100	0	97	96
221	100	100	-	-	97	100	73	99	100
222	98	77	-	-	0	100	0	90	96
223	98	88	-	-	0	100	0	97	99
224	-	100	-	-	89	100	54	100	94
225	99	68	-	-	0	100	0	99	100
226	97	97	-	-	60	100	0	99	100
227	0	0	-	-	0	100	0	95	96
228	68	40	-	-	0	100	0	96	81
229	99	99	-	-	64	100	9	97	98
230	40	0	-	-	0	100	0	94	95
231	33	58	-	-	0	100	9	94	99
232	79	-	-	-	-	100	-	90	99
233	36	-	-	-	-	100	-	91	89

Cmpd No.	測試 A	測試 B	測試 C	測試 D	測試 E	測試 F	測試 G	測試 H	測試 I
234	97	-	-	-	-	100	-	91	79
235	99	-	-	-	-	100	-	96	90
236	47	-	-	-	-	100	-	28	0
237	99	-	-	-	-	100	-	92	95
238	100	-	-	-	-	100	-	100	100
239	100	100	0	-	99	100	100	100	99
240	100	-	-	-	-	100	-	100	100
241	100	-	-	-	-	100	-	100	100
242	99*	-	-	-	-	100*	-	96*	99*
243	100	-	-	-	-	100	-	99	100
244	100	-	-	-	-	100	-	100	100
245	100	-	-	-	-	100	-	100	100
246	100	-	-	-	-	100	-	98	99
247	100	-	-	-	-	100	-	100	100
248	99	-	-	-	-	100	-	99	99
249	100	-	-	-	-	100	-	98	92
250	0	-	-	-	-	100	-	100	89
251	100	-	-	-	-	100	-	100	100
252	100	-	-	-	-	100	-	100	100
253	100	-	-	-	-	100	-	100	100
254	100	-	-	-	-	100	-	100	100
255	100*	-	-	-	-	100*	-	99*	81*
256	99*	-	-	-	-	100*	-	95*	64*
257	100*	-	-	-	31*	100*	-	63*	27*
258	100*	-	-	-	0*	100*	-	9*	0*
259	100*	-	-	-	0*	100*	-	82*	90*
260	100*	-	-	-	0*	100*	-	85*	90*
261	-	-	-	-	0*	100*	-	97*	95*
262	97*	-	-	-	0*	100*	-	85*	79*
263	99*	-	-	-	0*	100*	-	79*	13*
264	100*	-	-	-	0*	100*	-	97*	81*
265	100	-	-	-	-	100	-	99	100
266	99	-	-	-	-	100	-	99	99
267	100	-	-	-	-	100	-	100	100
268	100	-	-	-	-	100	-	99	100

104 年 6 月 8 日修正替換頁

Cmpd No.	測試 A	測試 B	測試 C	測試 D	測試 E	測試 F	測試 G	測試 H	測試 I
269	100	-	-	-	-	100	-	99	100
270	98*	-	-	-	-	100*	-	41*	91*
271	99*	-	-	-	-	100*	-	97*	98*
272	100	-	-	-	-	100	-	99	100
275	100	99	0	-	60	100	9	95	100
276	100*	-	-	-	-	100*	-	99*	92*

「Cmpd No.」代表化合物編號。

註解 1：在較早測試中等級為「65」。

測試 K、L 與 M

製備用於測試 K、L 與 M 之測試組成物的通用方法如下。化合物 81、5-氯-6-(2,4,6-三氟苯基)-7-(4-甲哌啶-1-基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶(BAS600)、環克座、異吡聯(isopyrazam)、吡嗪菌胺、撲殺熱、快諾芬與萆孢菌素係取得為未經配製、工業級原料。亞托敏、白克列、四氯異苯腈、氫氧化銅、克絕、待克利、達滅芬、依普座、芬普福、扶吉胺、護汰寧、福爾培、依普同、丙森鋅、鋅錳乃浦、右滅達樂(亦已知為滅達樂-M)、邁克尼、啞菌酯、丙氧喹啉、丙硫菌唑、百克敏、四克利與三環唑(tricyclozole)係取得為經配製產品，其以分別商標名 AMISTAR、ENDURA、BRAVO、KOCIDE、CURZATE、SCORE、ACROBAT、OPUS、CORBEL、OMEGA、MAXIM、PHALTAN、ROVRAL、MELODY、MANZATE、RIDOMIL GOLD、NOVA、ACANTO、TALIUS、PROLINE、HEADLINE、DOMARK 以及 BEAM 進行銷售。先將未經配製的原料溶於丙酮中，然後以所

欲濃度(以 ppm 為單位)懸浮在丙酮及純化水(50/50 體積混合)，其含有 250 ppm 的表面活性劑 Trem[®] 014 (多元醇酯)。將已配製之原料分散在足夠的水中以得到所欲濃度，並且有機溶劑或界面活性劑皆不加入於懸浮液中。所得測試混合物而後用於測試 K、L 與 M 中。噴灑一 200 ppm 的測試懸浮液於測試植物上直到溢流程度，其相當於約 800 g/ha 的施用率。測試重複三次並將結果報告為三重複之平均值。

藉由 Colby 等式之助確立兩種活性成分間之協同效果存在(請參見 Colby, S. R. “Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations”, *Weeds*, (1967), 15, 20-22)：

$$p = A + B - \left[\frac{A \times B}{100} \right]。$$

利用 Colby 之方法，兩種活性成分間之協同交互作用存在的確立方式首先係基於兩種成分單獨使用之活性計算混合物之預測活性 p。若 p 低於實驗所確立之效果，則兩者間具有協同作用。上述計算中，A 為對照於一個組分以施用率 x 單獨施用之殺真菌活性百分比。B 項為對照於第二個組分以施用率 y 施用之殺真菌活性百分比。此等式估計 p，即若其效果為直接相加且無交互作用發生下，A 於 x 施用率下且 B 於 y 施用率下，該混合物之預期殺真菌活性。

測試 K(即測試 K1、K2、K3、K4、K5)

將測試懸浮液噴灑於小麥苗至溢流為止。於第二天將小麥白粉病菌(*Blumeria graminis* f. sp. *tritici*)(亦已知為 *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*，小麥白粉病之致病劑)孢子粉接種於幼苗，於 20°C 生長箱中培養 7 天，在此時間後，進行外觀疾病評級。

測試 L(即測試 L1、L2、L3、L4、L5)

將測試懸浮液噴灑於小麥苗至溢流為止。於第二天將小麥葉鏽病菌(*Puccinia recondita* f. sp. *tritici*)(小麥葉鏽病的致病劑)孢子懸浮液接種於幼苗，於 20°C 飽和蒸氣壓下培養 24 小時，接著移至 20°C 生長箱中置放 6 天，在此時間後，進行外觀疾病評級。

測試 M(即測試 M1、M2、M3、M4、M5)

將測試懸浮液噴灑於小麥苗至溢流為止。於第二天將小麥殼針孢葉枯病菌(*Septoria tritici*)(小麥葉斑病的致病劑)孢子粉接種於幼苗，於 24°C 飽和蒸氣壓下培養 48 小時然後該幼苗移到 20°C 生長箱放置額外 19 天，在此時間後，進行外觀疾病評級。

測試 K-M 之結果係顯示於下列表 B 至 K。等級 100 表示 100% 疾病防治，而等級 0 表示無疾病防治效果(相對於控制組)。破折號(-)代表無測試結果。標示為「Obsd」之欄位代表其為由三次重複觀測到之結果的平均值。標示「Exp」之欄位代表對於各個處理用混合物利用 Colby 等式計算得之期望效果。

表 B

化合物 81 單獨及其與快諾芬、撲殺熱、鋅錳乃浦、依普同、白克列、氫氧化銅、克絕或丙氧喹啉之混合物用於防治小麥白粉病或葉鏽病之實測與預期效果

化合物 81 之 施用率(ppm)	組分(b)	組分(b)之施 用率(ppm)	測試 K1		測試 L1	
			Obsd	Exp	Obsd	Exp
0	無	0	0		0	
1	無	0	0		88	
2	無	0	87		68	
5	無	0	99		91	
10	無	0	100		98	
0	快諾芬	10			0	
0	快諾芬	40			0	
0	快諾芬	200			0	
2	快諾芬	10			18	68
2	快諾芬	40			23	68
2	快諾芬	200			38	68
5	快諾芬	10			60	91
5	快諾芬	40			41	91
5	快諾芬	200			47	91
0	撲殺熱	10	68		9	
0	撲殺熱	40	21		18	
0	撲殺熱	200	71		18	
2	撲殺熱	10	97	96	54	71
2	撲殺熱	40	99	90	85	74
2	撲殺熱	200	98	96	74	74
5	撲殺熱	10	100	100	92	92
5	撲殺熱	40	100	99	96	93
5	撲殺熱	200	100	100	94	93
0	鋅錳乃浦	10	0		54	
0	鋅錳乃浦	40	0		88	
0	鋅錳乃浦	200	0		98	
2	鋅錳乃浦	10	79	87	80	85
2	鋅錳乃浦	40	87	87	91	96
2	鋅錳乃浦	200	84	87	99	99
5	鋅錳乃浦	10	96	99	85	96
5	鋅錳乃浦	40	99	99	98	99

104 年 6 月 8 日修正替換頁

化合物 81 之 施用率(ppm)	組分(b)	組分(b)之施 用率(ppm)	測試 K1		測試 L1	
			Obsd	Exp	Obsd	Exp
5	鋅 錳 乃 浦	200	99	99	99	100
0	依 普 同	10	0		0	
0	依 普 同	40	0		0	
0	依 普 同	200	21		0	
2	依 普 同	10	96	87	27	68
2	依 普 同	40	92	87	27	68
2	依 普 同	200	94	90	41	68
5	依 普 同	10	99	99	68	91
5	依 普 同	40	99	99	80	91
5	依 普 同	200	99	99	85	91
0	白 克 列	10	0		0	
0	白 克 列	40	0		54	
0	白 克 列	200	0		92	
2	白 克 列	10	0	87	76	68
2	白 克 列	40	0	87	86	85
2	白 克 列	200	64	87	99	97
5	白 克 列	10	86	99	89	91
5	白 克 列	40	94	99	98	96
5	白 克 列	200	97	99	98	99
0	氫 氧 化 銅	10	0		0	
0	氫 氧 化 銅	40	0		0	
0	氫 氧 化 銅	200	0		0	
2	氫 氧 化 銅	10	71	87	9	68
2	氫 氧 化 銅	40	0	87	0	68
2	氫 氧 化 銅	200	0	87	0	68
5	氫 氧 化 銅	10	97	99	41	91
5	氫 氧 化 銅	40	94	99	18	91
5	氫 氧 化 銅	200	93	99	41	91
0	克 絕	10	0		0	
0	克 絕	40	0		0	
0	克 絕	200	50		18	
2	克 絕	10	73	87	9	68
2	克 絕	40	89	87	9	68
2	克 絕	200	91	93	54	74
5	克 絕	10	96	99	18	91
5	克 絕	40	98	99	54	91
5	克 絕	200	97	100	74	93
0	丙 氧 喹 啉	10			0	
0	丙 氧 喹 啉	40			0	

化合物 81 之 施用率(ppm)	組分(b)	組分(b)之施 用率(ppm)	測試 K1		測試 L1	
			Obsd	Exp	Obsd	Exp
0	丙氧嗪啉	200			0	
2	丙氧嗪啉	10			0	68
2	丙氧嗪啉	40			18	68
2	丙氧嗪啉	200			27	68
5	丙氧嗪啉	10			18	91
5	丙氧嗪啉	40			27	91
5	丙氧嗪啉	200			68	91

表 C

化合物 81 單獨及其與四氯異苯腈、三賽唑、扶吉胺、達滅芬、護汰寧、丙森鋅、滅達樂-M 或福爾培之混合物用於防治小麥白粉病或葉鏽病之實測與預期效果

化合物 81 之 施用率(ppm)	組分(b)	組分(b)之施 用率(ppm)	測試 K2		測試 L2	
			Obsd	Exp	Obsd	Exp
0	無	0	63		0	
1	無	0	91		9	
2	無	0	91		27	
5	無	0	91		74	
10	無	0	100		91	
0	四氯異苯腈	10	58		0	
0	四氯異苯腈	40	68		41	
0	四氯異苯腈	200	79		91	
2	四氯異苯腈	10	92	96	18	27
2	四氯異苯腈	40	100	97	85	57
2	四氯異苯腈	200	97	98	96	93
5	四氯異苯腈	10	100	96	66	74
5	四氯異苯腈	40	100	97	88	85
5	四氯異苯腈	200	100	98	96	98
0	三賽唑	10	0		0	
0	三賽唑	40	29		0	
0	三賽唑	200	79		0	
2	三賽唑	10	99	91	27	27
2	三賽唑	40	99	94	27	27
2	三賽唑	200	98	98	27	27
5	三賽唑	10	100	91	55	74
5	三賽唑	40	100	94	68	74

104 年 6 月 8 日修正替換頁

化合物 81 之 施用率(ppm)	組分(b)	組分(b)之施 用率(ppm)	測試 K2		測試 L2	
			Obsd	Exp	Obsd	Exp
5	三賽唑	200	100	98	80	74
0	扶吉胺	10	85		18	
0	扶吉胺	40	96		41	
0	扶吉胺	200	100		74	
2	扶吉胺	10	84	99	41	41
2	扶吉胺	40	99	100	68	57
2	扶吉胺	200	99	100	91	81
5	扶吉胺	10	100	99	80	79
5	扶吉胺	40	100	100	80	85
5	扶吉胺	200	100	100	91	93
0	達滅芬	10	82		9	
0	達滅芬	40	71		9	
0	達滅芬	200	82		0	
2	達滅芬	10	99	98	18	34
2	達滅芬	40	100	98	18	34
2	達滅芬	200	99	98	27	27
5	達滅芬	10	100	98	60	76
5	達滅芬	40	100	98	68	76
5	達滅芬	200	100	98	68	74
0	護汰寧	10	82		0	
0	護汰寧	40	92		0	
0	護汰寧	200	96		9	
2	護汰寧	10	100	98	27	27
2	護汰寧	40	99	99	27	27
2	護汰寧	200	100	100	27	34
5	護汰寧	10	100	98	41	74
5	護汰寧	40	100	99	55	74
5	護汰寧	200	100	100	74	76
0	丙森鋅	10	71		0	
0	丙森鋅	40	74		0	
0	丙森鋅	200	56		9	
2	丙森鋅	10	100	98	27	27
2	丙森鋅	40	100	98	27	27
2	丙森鋅	200	99	96	27	34
5	丙森鋅	10	100	98	74	74
5	丙森鋅	40	100	98	74	74
5	丙森鋅	200	100	96	85	76
0	滅達樂-M	10	56		0	
0	滅達樂	40	64		0	

化合物 81 之 施用率(ppm)	組分(b)	組分(b)之施 用率(ppm)	測試 K2		測試 L2	
			Obsd	Exp	Obsd	Exp
0	滅達樂	200	21		0	
2	滅達樂	10	96	96	27	27
2	滅達樂	40	99	97	27	27
2	滅達樂	200	99	93	27	27
5	滅達樂	10	100	96	55	74
5	滅達樂	40	100	97	55	74
5	滅達樂	200	100	93	68	74
0	福爾培	10	0		0	
0	福爾培	40	0		27	
0	福爾培	200	21		55	
2	福爾培	10	93	91	0	27
2	福爾培	40	96	91	27	47
2	福爾培	200	66	93	80	67
5	福爾培	10	100	91	74	74
5	福爾培	40	100	91	88	81
5	福爾培	200	100	93	93	88

表 D

化合物 81 單獨及其與異吡聯(isopyrazam)、BAS600、必殺
芬、吡嗪菌胺、萁孢菌素、邁克尼或芬普福之混合物用於防
治小麥白粉病或葉鏽病之實測與預期效果

化合物 81 之 施用率(ppm)	組分(b)	組分(b)之施 用率(ppm)	測試 K3		測試 L3	
			Obsd	Exp	Obsd	Exp
0	無	0	0		0	
1	無	0	0		9	
2	無	0	0		9	
5	無	0	90		41	
10	無	0	99		88	
0	異吡聯 (isopyrazam)	0.08	0			
0	異吡聯 (isopyrazam)	0.4	50			
0	異吡聯 (isopyrazam)	2	99			
0	異吡聯 (isopyrazam)	10	99			

104年6月8日修正替換頁

化合物 81 之 施用率(ppm)	組分(b)	組分(b)之施 用率(ppm)	測試 K3		測試 L3	
			Obsd	Exp	Obsd	Exp
2	異吡聯 (isopyrazam)	0.08	0	0		
2	異吡聯 (isopyrazam)	0.4	64	50		
2	異吡聯 (isopyrazam)	2	94	99		
2	異吡聯 (isopyrazam)	10	100	99		
5	異吡聯 (isopyrazam)	0.08	99	90		
5	異吡聯 (isopyrazam)	0.4	100	95		
5	異吡聯 (isopyrazam)	2	100	100		
5	異吡聯 (isopyrazam)	10	100	100		
0	BAS600	0.08	0		74	
0	BAS600	0.4	0		88	
0	BAS600	2	96		99	
0	BAS600	10	100		100	
2	BAS600	0.08	0	0	74	76
2	BAS600	0.4	0	0	94	89
2	BAS600	2	93	96	100	99
2	BAS600	10	99	100	100	100
5	BAS600	0.08	100	90	92	84
5	BAS600	0.4	99	90	99	93
5	BAS600	2	100	100	100	99
5	BAS600	10	100	100	100	100
0	必殺芬	0.08	0		9	
0	必殺芬	0.4	0		88	
0	必殺芬	2	64		99	
0	必殺芬	10	99		100	
2	必殺芬	0.08	0	0	18	17
2	必殺芬	0.4	0	0	80	89
2	必殺芬	2	90	64	99	99
2	必殺芬	10	99	99	100	100
5	必殺芬	0.08	99	90	68	46
5	必殺芬	0.4	100	90	94	93
5	必殺芬	2	100	96	100	99
5	必殺芬	10	100	100	100	100

104 年 6 月 8 日修正替換頁

化合物 81 之 施用率(ppm)	組分(b)	組分(b)之施 用率(ppm)	測試 K3		測試 L3	
			Obsd	Exp	Obsd	Exp
0	吡噻菌胺	0.08	0			
0	吡噻菌胺	0.4	0			
0	吡噻菌胺	2	99			
0	吡噻菌胺	10	100			
2	吡噻菌胺	0.08	0	0		
2	吡噻菌胺	0.4	42	0		
2	吡噻菌胺	2	99	99		
2	吡噻菌胺	10	100	100		
5	吡噻菌胺	0.08	99	90		
5	吡噻菌胺	0.4	100	90		
5	吡噻菌胺	2	100	100		
5	吡噻菌胺	10	100	100		
0	萁孢菌素	0.4	0		0	
0	萁孢菌素	2	0		0	
0	萁孢菌素	10	0		0	
0	萁孢菌素	40	99		91	
2	萁孢菌素	0.4	0	0	18	9
2	萁孢菌素	2	0	0	9	9
2	萁孢菌素	10	0	0	9	9
2	萁孢菌素	40	100	99	60	92
5	萁孢菌素	0.4	97	90	45	41
5	萁孢菌素	2	96	90	41	41
5	萁孢菌素	10	98	90	80	41
5	萁孢菌素	40	100	100	95	95
0	邁克尼	0.4	0		0	
0	邁克尼	2	86		0	
0	邁克尼	10	99		41	
0	邁克尼	40	100		99	
2	邁克尼	0.4	42	0	0	9
2	邁克尼	2	93	86	0	9
2	邁克尼	10	100	99	41	46
2	邁克尼	40	100	100	100	99
5	邁克尼	0.4	98	90	27	41
5	邁克尼	2	99	99	68	41
5	邁克尼	10	100	100	93	65
5	邁克尼	40	100	100	100	99
0	芬普福	0.4	50		0	
0	芬普福	2	96		0	
0	芬普福	10	100		88	

化合物 81 之 施用率(ppm)	組分(b)	組分(b)之施 用率(ppm)	測試 K3		測試 L3	
			Obsd	Exp	Obsd	Exp
0	芬普福	40	100		100	
2	芬普福	0.4	85	50	0	9
2	芬普福	2	97	96	41	9
2	芬普福	10	100	100	97	89
2	芬普福	40	100	100	100	100
5	芬普福	0.4	96	95	54	41
5	芬普福	2	100	100	83	41
5	芬普福	10	100	100	99	93
5	芬普福	40	100	100	100	100

表 E

化合物 81 單獨及其與待克利、亞托敏、四克利、百克敏、
丙硫菌唑、啞氧菌酯或依普座之混合物用於防治小麥白粉病
或葉鏽病之實測與預期效果

化合物 81 之 施用率(ppm)	組分(b)	組分(b)之施 用率(ppm)	測試 K4		測試 L4	
			Obsd	Exp	Obsd	Exp
0	無	0	0		0	
1	無	0	0		0	
2	無	0	0		27	
5	無	0	0		68	
10	無	0	—		88	
0	待克利	0.08	0			
0	待克利	0.4	0			
0	待克利	2	81			
0	待克利	10	99			
2	待克利	0.08	0	0		
2	待克利	0.4	21	0		
2	待克利	2	90	81		
2	待克利	10	100	99		
5	待克利	0.08	98	0		
5	待克利	0.4	97	0		
5	待克利	2	98	81		
5	待克利	10	100	99		
0	亞托敏	0.08	0			
0	亞托敏	0.4	0			
0	亞托敏	2	0			

104 年 6 月 8 日修正替換頁

化合物 81 之 施用率(ppm)	組分(b)	組分(b)之施 用率(ppm)	測試 K4		測試 L4	
			Obsd	Exp	Obsd	Exp
0	亞托敏	10	96			
2	亞托敏	0.08	0	0		
2	亞托敏	0.4	0	0		
2	亞托敏	2	0	0		
2	亞托敏	10	97	96		
5	亞托敏	0.08	97	0		
5	亞托敏	0.4	96	0		
5	亞托敏	2	98	0		
5	亞托敏	10	100	96		
0	四克利	0.08	0		0	
0	四克利	0.4	21		0	
0	四克利	2	93		27	
0	四克利	10	97		99	
2	四克利	0.08	0	0	0	27
2	四克利	0.4	0	21	9	27
2	四克利	2	55	93	60	47
2	四克利	10	99	97	100	99
5	四克利	0.08	94	0	74	68
5	四克利	0.4	94	21	74	68
5	四克利	2	97	93	98	77
5	四克利	10	100	97	100	100
0	百克敏	0.08	0		9	
0	百克敏	0.4	0		80	
0	百克敏	2	0		98	
0	百克敏	10	93		100	
2	百克敏	0.08	0	0	27	34
2	百克敏	0.4	0	0	85	85
2	百克敏	2	58	0	97	99
2	百克敏	10	94	93	100	100
5	百克敏	0.08	97	0	74	71
5	百克敏	0.4	96	0	94	94
5	百克敏	2	98	0	100	99
5	百克敏	10	99	93	100	100
0	丙硫菌唑	0.08	0		0	
0	丙硫菌唑	0.4	0		0	
0	丙硫菌唑	2	0		9	
0	丙硫菌唑	10	93		9	
2	丙硫菌唑	0.08	0	0	0	27
2	丙硫菌唑	0.4	0	0	0	27

104 年 6 月 8 日修正替換頁

化合物 81 之 施用率(ppm)	組分(b)	組分(b)之施 用率(ppm)	測試 K4		測試 L4	
			Obsd	Exp	Obsd	Exp
2	丙硫菌唑	2	47	0	0	34
2	丙硫菌唑	10	98	93	27	34
5	丙硫菌唑	0.08	96	0	80	68
5	丙硫菌唑	0.4	96	0	74	68
5	丙硫菌唑	2	97	0	55	71
5	丙硫菌唑	10	98	93	74	71
0	啞氧菌酯	0.08	0		0	
0	啞氧菌酯	0.4	0		9	
0	啞氧菌酯	2	0		82	
0	啞氧菌酯	10	99		100	
2	啞氧菌酯	0.08	0	0	0	27
2	啞氧菌酯	0.4	0	0	27	34
2	啞氧菌酯	2	42	0	85	87
2	啞氧菌酯	10	100	99	100	100
5	啞氧菌酯	0.08	93	0	60	68
5	啞氧菌酯	0.4	95	0	80	71
5	啞氧菌酯	2	96	0	90	94
5	啞氧菌酯	10	100	99	100	100
0	依普座	0.08	0		0	
0	依普座	0.4	90		93	
0	依普座	2	98		99	
0	依普座	10	100		100	
2	依普座	0.08	0	0	55	27
2	依普座	0.4	29	90	97	95
2	依普座	2	99	98	99	99
2	依普座	10	100	100	100	100
5	依普座	0.08	93	0	91	68
5	依普座	0.4	98	90	100	98
5	依普座	2	100	98	100	100
5	依普座	10	100	100	100	100

表 F

化合物 81 單獨及其與快諾芬、環克座、吡嗪菌胺、異吡聯
(isopyrazam)、待克利、亞托敏或丙氧喹啉之混合物用於防
治小麥白粉病或葉鏽病之實測與預期效果

化合物 81 之 施用率(ppm)	組分(b)	組分(b)之施 用率(ppm)	測試 K5		測試 L5	
			Obsd	Exp	Obsd	Exp
0	無	0	0		0	
1	無	0	0		18	
2	無	0	0		27	
5	無	0	0		55	
10	無	0	100		82	
0	快諾芬	0.016	21		—	
0	快諾芬	0.08	29		—	
0	快諾芬	0.4	64		—	
0	快諾芬	2	93		—	
2	快諾芬	0.016	90	21	—	
2	快諾芬	0.08	87	29	—	
2	快諾芬	0.4	90	64	—	
2	快諾芬	2	99	93	—	
5	快諾芬	0.016	99	21	—	
5	快諾芬	0.08	100	29	—	
5	快諾芬	0.4	100	64	—	
5	快諾芬	2	100	93	—	
0	環克座	0.016	64		27	
0	環克座	0.08	64		80	
0	環克座	0.4	79		92	
0	環克座	2	96		100	
2	環克座	0.016	42	64	55	47
2	環克座	0.08	64	64	74	85
2	環克座	0.4	96	79	93	94
2	環克座	2	100	96	100	100
5	環克座	0.016	100	64	68	67
5	環克座	0.08	99	64	97	91
5	環克座	0.4	100	79	98	96
5	環克座	2	100	96	100	100
0	吡嗪菌胺	0.016	—		9	
0	吡嗪菌胺	0.08	—		55	
0	吡嗪菌胺	0.4	—		68	
0	吡嗪菌胺	2	—		99	
2	吡嗪菌胺	0.016	—		55	34
2	吡嗪菌胺	0.08	—		68	67
2	吡嗪菌胺	0.4	—		68	77
2	吡嗪菌胺	2	—		99	99

104 年 6 月 8 日修正替換頁

化合物 81 之 施用率(ppm)	組分(b)	組分(b)之施 用率(ppm)	測試 K5		測試 L5	
			Obsd	Exp	Obsd	Exp
5	吡嗪菌胺	0.016	—		74	59
5	吡嗪菌胺	0.08	—		80	79
5	吡嗪菌胺	0.4	—		88	85
5	吡嗪菌胺	2	—		100	100
0	異吡聯 (isopyrazam)	0.016	—		68	
0	異吡聯 (isopyrazam)	0.08	—		89	
0	異吡聯 (isopyrazam)	0.4	—		100	
0	異吡聯 (isopyrazam)	2	—		100	
2	異吡聯 (isopyrazam)	0.016	—		74	77
2	異吡聯 (isopyrazam)	0.08	—		88	92
2	異吡聯 (isopyrazam)	0.4	—		100	100
2	異吡聯 (isopyrazam)	2	—		100	100
5	異吡聯 (isopyrazam)	0.016	—		88	85
5	異吡聯 (isopyrazam)	0.08	—		99	95
5	異吡聯 (isopyrazam)	0.4	—		100	100
5	異吡聯 (isopyrazam)	2	—		100	100
0	待克利	0.016	—		68	
0	待克利	0.08	—		68	
0	待克利	0.4	—		92	
0	待克利	2	—		100	
2	待克利	0.016	—		27	77
2	待克利	0.08	—		41	77
2	待克利	0.4	—		99	94
2	待克利	2	—		100	100
5	待克利	0.016	—		74	85
5	待克利	0.08	—		80	85
5	待克利	0.4	—		100	96
5	待克利	2	—		100	100

化合物 81 之 施用率(ppm)	組分(b)	組分(b)之施 用率(ppm)	測試 K5		測試 L5	
			Obsd	Exp	Obsd	Exp
0	亞托敏	0.016	—		0	
0	亞托敏	0.08	—		68	
0	亞托敏	0.4	—		100	
0	亞托敏	2	—		100	
2	亞托敏	0.016	—		27	27
2	亞托敏	0.08	—		74	77
2	亞托敏	0.4	—		100	100
2	亞托敏	2	—		100	100
5	亞托敏	0.016	—		74	55
5	亞托敏	0.08	—		97	85
5	亞托敏	0.4	—		100	100
5	亞托敏	2	—		100	100
0	丙氧嗪啉	0.016	0		—	
0	丙氧嗪啉	0.08	0		—	
0	丙氧嗪啉	0.4	0		—	
0	丙氧嗪啉	2	71		—	
2	丙氧嗪啉	0.016	0	0	—	
2	丙氧嗪啉	0.08	0	0	—	
2	丙氧嗪啉	0.4	0	0	—	
2	丙氧嗪啉	2	87	71	—	
5	丙氧嗪啉	0.016	87	0	—	
5	丙氧嗪啉	0.08	89	0	—	
5	丙氧嗪啉	0.4	93	0	—	
5	丙氧嗪啉	2	98	71	—	

表 G

化合物 81 單獨及其與撲殺熱、鋅錳乃浦、依普同、白克列、
氫氧化銅、克絕或四氯異苯腈之混合物用於防治葉斑病之實
測與預期效果

化合物 81 之施用率 (ppm)	組分(b)	組分(b)之施用率 (ppm)	測試 M1	
			Obsd	Exp
0	無	0	0	
0.01	無	0	0	
0.1	無	0	0	
1	無	0	86	
10	無	0	100	

化合物 81 之施用率 (ppm)	組分(b)	組分(b)之施用率 (ppm)	測試 M1	
			Obsd	Exp
0	撲殺熱	10	0	
0	撲殺熱	40	0	
0	撲殺熱	200	0	
0.1	撲殺熱	10	0	0
0.1	撲殺熱	40	0	0
0.1	撲殺熱	200	25	0
1	撲殺熱	10	87	86
1	撲殺熱	40	94	86
1	撲殺熱	200	87	86
0	鋅錳乃浦	10	0	
0	鋅錳乃浦	40	55	
0	鋅錳乃浦	200	91	
0.1	鋅錳乃浦	10	0	0
0.1	鋅錳乃浦	40	63	55
0.1	鋅錳乃浦	200	96	91
1	鋅錳乃浦	10	81	86
1	鋅錳乃浦	40	98	94
1	鋅錳乃浦	200	100	99
0	依普同	10	0	
0	依普同	40	0	
0	依普同	200	0	
0.1	依普同	10	0	0
0.1	依普同	40	0	0
0.1	依普同	200	22	0
1	依普同	10	88	86
1	依普同	40	91	86
1	依普同	200	98	86
0	白克列	10	77	
0	白克列	40	90	
0	白克列	200	99	
0.1	白克列	10	72	77
0.1	白克列	40	98	90
0.1	白克列	200	98	99
1	白克列	10	99	97
1	白克列	40	100	99
1	白克列	200	100	100
0	氫氧化銅	10	0	
0	氫氧化銅	40	45	
0	氫氧化銅	200	77	

化合物 81 之施用率 (ppm)	組分(b)	組分(b)之施用率 (ppm)	測試 M1	
			Obsd	Exp
0.1	氫氧化銅	10	0	0
0.1	氫氧化銅	40	25	45
0.1	氫氧化銅	200	87	77
1	氫氧化銅	10	72	86
1	氫氧化銅	40	93	92
1	氫氧化銅	200	99	97
0	克絕	10	0	
0	克絕	40	0	
0	克絕	200	0	
0.1	克絕	10	0	0
0.1	克絕	40	0	0
0.1	克絕	200	0	0
1	克絕	10	96	86
1	克絕	40	85	86
1	克絕	200	96	86
0	四氯異苯腈	10	0	
0	四氯異苯腈	40	42	
0	四氯異苯腈	200	99	
0.1	四氯異苯腈	10	0	0
0.1	四氯異苯腈	40	75	42
0.1	四氯異苯腈	200	98	99
1	四氯異苯腈	10	72	86
1	四氯異苯腈	40	80	92
1	四氯異苯腈	200	99	100

表 H

化合物 81 單獨及其與 BAS600、異吡聯(isopyrazam)、吡噻菌胺、必殺芬或環克座之混合物用於防治葉斑病之實測與預期效果

化合物 81 之施用率 (ppm)	組分(b)	組分(b)之施用率 (ppm)	測試 M2	
			Obsd	Exp
0	無	0	0	
0.01	無	0	0	
0.1	無	0	0	
1	無	0	95	
10	無	0	100	

104 年 6 月 8 日修正替換頁

化合物 81 之施用率 (ppm)	組分(b)	組分(b)之施用率 (ppm)	測試 M2	
			Obsd	Exp
0	BAS600	0.016	0	
0	BAS600	0.08	0	
0	BAS600	0.4	93	
0	BAS600	2	100	
0.1	BAS600	0.02	0	0
0.1	BAS600	0.08	38	0
0.1	BAS600	0.40	96	93
0.1	BAS600	2	100	100
1	BAS600	0.02	65	95
1	BAS600	0.08	85	95
1	BAS600	0.40	97	100
1	BAS600	2	99	100
0	異吡聯 (isopyrazam)	0.08	0	
0	異吡聯 (isopyrazam)	0.40	77	
0	異吡聯 (isopyrazam)	2	93	
0	異吡聯 (isopyrazam)	10	100	
0.1	異吡聯 (isopyrazam)	0.08	0	0
0.1	異吡聯 (isopyrazam)	0.40	72	77
0.1	異吡聯 (isopyrazam)	2	—	
0.1	異吡聯 (isopyrazam)	10	—	
1	異吡聯 (isopyrazam)	0.08	—	
1	異吡聯 (isopyrazam)	0.40	80	99
1	異吡聯 (isopyrazam)	2	—	
1	異吡聯 (isopyrazam)	10	100	100
0	吡噻菌胺	0.08	0	
0	吡噻菌胺	0.40	0	
0	吡噻菌胺	2	—	
0	吡噻菌胺	10	—	

104 年 6 月 8 日修正替換頁

化合物 81 之施用率 (ppm)	組分(b)	組分(b)之施用率 (ppm)	測試 M2	
			Obsd	Exp
0.1	吡嘧菌胺	0.08	0	0
0.1	吡嘧菌胺	0.40	17	0
0.1	吡嘧菌胺	2	—	
0.1	吡嘧菌胺	10	99	
1	吡嘧菌胺	0.08	83	95
1	吡嘧菌胺	0.40	73	95
1	吡嘧菌胺	2	—	
1	吡嘧菌胺	10	99	
0	必殺芬	0.08	0	
0	必殺芬	0.40	33	
0	必殺芬	2	89	
0	必殺芬	10	—	
0.1	必殺芬	0.08	0	0
0.1	必殺芬	0.40	33	33
0.1	必殺芬	2	83	89
0.1	必殺芬	10	100	
1	必殺芬	0.08	—	
1	必殺芬	0.4	85	97
1	必殺芬	2	—	
1	必殺芬	10	—	
0	環克座	0.4	0	
0	環克座	2	0	
0	環克座	10	0	
0	環克座	40	98	
0.1	環克座	0.4	0	0
0.1	環克座	2	0	0
0.1	環克座	10	0	0
0.1	環克座	40	98	98
1	環克座	0.4	73	95
1	環克座	2	63	95
1	環克座	10	97	95
1	環克座	40	100	100

表 I

化合物 81 單獨及其與護汰寧、依普座、丙硫菌唑、待克利
或芬普福之混合物用於防治葉斑病之實測與預期效果

化合物 81 之施用率 (ppm)	組分(b)	組分(b)之施用率 (ppm)	測試 M3	
			Obsd	Exp
0	無	0	0	
0.01	無	0	0	
0.1	無	0	0	
1	無	0	52	
10	無	0	100	
0	護汰寧	0.08	0	
0	護汰寧	0.4	0	
0	護汰寧	2	37	
0	護汰寧	10	67	
0.1	護汰寧	0.08	0	0
0.1	護汰寧	0.4	0	0
0.1	護汰寧	2	30	37
0.1	護汰寧	10	57	67
1	護汰寧	0.08	83	52
1	護汰寧	0.4	45	52
1	護汰寧	2	68	69
1	護汰寧	10	78	84
0	依普座	0.4	0	
0	依普座	2	0	
0	依普座	10	76	
0	依普座	40	100	
0.1	依普座	0.4	0	0
0.1	依普座	2	0	0
0.1	依普座	10	75	76
0.1	依普座	40	98	100
1	依普座	0.4	78	52
1	依普座	2	78	52
1	依普座	10	97	89
1	依普座	40	100	100
0	丙硫菌唑	0.4	0	
0	丙硫菌唑	2	0	
0	丙硫菌唑	10	18	
0	丙硫菌唑	40	85	
0.1	丙硫菌唑	0.4	0	0
0.1	丙硫菌唑	2	0	0
0.1	丙硫菌唑	10	25	18
0.1	丙硫菌唑	40	—	

化合物 81 之施用率 (ppm)	組分(b)	組分(b)之施用率 (ppm)	測試 M3	
			Obsd	Exp
1	丙硫菌唑	0.4	48	52
1	丙硫菌唑	2	25	52
1	丙硫菌唑	10	73	61
1	丙硫菌唑	40	88	93
0	待克利	0.4	0	
0	待克利	2	0	
0	待克利	10	52	
0	待克利	40	95	
0.1	待克利	0.4	0	0
0.1	待克利	2	0	0
0.1	待克利	10	57	52
0.1	待克利	40	98	95
1	待克利	0.4	78	52
1	待克利	2	50	52
1	待克利	10	88	77
1	待克利	40	100	97
0	芬普福	2	0	
0	芬普福	10	0	
0	芬普福	40	0	
0	芬普福	200	0	
0.1	芬普福	2	0	0
0.1	芬普福	10	0	0
0.1	芬普福	40	0	0
0.1	芬普福	200	0	0
1	芬普福	2	85	52
1	芬普福	10	75	52
1	芬普福	40	86	52
1	芬普福	200	98	52

表 J

化合物 81 單獨及其與百克敏、三賽唑、扶吉胺、達滅芬、
丙森鋅、滅達樂-M、福爾培或邁克尼之混合物用於防治葉斑
病之實測與預期效果

化合物 81 之施用率 (ppm)	組分(b)	組分(b)之施用率 (ppm)	測試 M4	
			Obsd	Exp
0	無	0	0	

104 年 6 月 8 日修正替換頁

化合物 81 之施用率 (ppm)	組分(b)	組分(b)之施用率 (ppm)	測試 M4	
			Obsd	Exp
0.01	無	0	0	
0.1	無	0	23	
1	無	0	66	
10	無	0	100	
0	百克敏	10	0	
0	百克敏	40	26	
0	百克敏	200	93	
0.1	百克敏	10	0	23
0.1	百克敏	40	32	43
0.1	百克敏	200	91	94
1	百克敏	10	79	66
1	百克敏	40	90	75
1	百克敏	200	97	98
0	三賽唑	10	0	
0	三賽唑	40	0	
0	三賽唑	200	0	
0.1	三賽唑	10	0	23
0.1	三賽唑	40	0	23
0.1	三賽唑	200	0	23
1	三賽唑	10	74	66
1	三賽唑	40	93	66
1	三賽唑	200	74	66
0	扶吉胺	10	0	
0	扶吉胺	40	0	
0	扶吉胺	200	93	
0.1	扶吉胺	10	13	23
0.1	扶吉胺	40	60	23
0.1	扶吉胺	200	85	95
1	扶吉胺	10	76	66
1	扶吉胺	40	97	66
1	扶吉胺	200	100	98
0	達滅芬	10	0	
0	達滅芬	40	0	
0	達滅芬	200	0	
0.1	達滅芬	10	0	23
0.1	達滅芬	40	0	23
0.1	達滅芬	200	16	23
1	達滅芬	10	93	66
1	達滅芬	40	91	66

104 年 6 月 8 日修正替換頁

化合物 81 之施用率 (ppm)	組分(b)	組分(b)之施用率 (ppm)	測試 M4	
			Obsd	Exp
1	達滅芬	200	0	66
0	丙森鋅	10	0	
0	丙森鋅	40	0	
0	丙森鋅	200	0	
0.1	丙森鋅	10	0	23
0.1	丙森鋅	40	23	23
0.1	丙森鋅	200	53	23
1	丙森鋅	10	81	66
1	丙森鋅	40	96	66
1	丙森鋅	200	96	66
0	滅達樂-M	10	0	
0	滅達樂	40	0	
0	滅達樂	200	0	
0.1	滅達樂	10	0	23
0.1	滅達樂	40	0	23
0.1	滅達樂	200	32	23
1	滅達樂	10	86	66
1	滅達樂	40	96	66
1	滅達樂	200	96	66
0	福爾培	10	0	
0	福爾培	40	73	
0	福爾培	200	91	
0.1	福爾培	10	32	23
0.1	福爾培	40	86	79
0.1	福爾培	200	93	93
1	福爾培	10	91	66
1	福爾培	40	91	91
1	福爾培	200	98	97
0	邁克尼	10	0	
0	邁克尼	40	44	
0	邁克尼	200	74	
0.1	邁克尼	10	13	23
0.1	邁克尼	40	0	57
0.1	邁克尼	200	61	80
1	邁克尼	10	16	66
1	邁克尼	40	91	81
1	邁克尼	200	74	91

表 K

化合物 81 單獨及其與快諾芬、亞托敏、啞氧菌酯、四克利、
 菴孢菌素或丙氧喹啉之混合物用於防治葉斑病之實測與預

期效果

化合物 81 之施用率 (ppm)	組分(b)	組分(b)之施用率 (ppm)	測試 M5	
			Obsd	Exp
0	無	0	0	
0.01	無	0	0	
0.1	無	0	3	
1	無	0	90	
10	無	0	100	
0	快諾芬	10	0	
0	快諾芬	40	0	
0	快諾芬	200	8	
0.1	快諾芬	10	0	3
0.1	快諾芬	40	0	3
0.1	快諾芬	200	0	11
1	快諾芬	10	95	90
1	快諾芬	40	99	90
1	快諾芬	200	99	91
0	亞托敏	10	0	
0	亞托敏	40	20	
0	亞托敏	200	50	
0.1	亞托敏	10	0	3
0.1	亞托敏	40	3	23
0.1	亞托敏	200	61	52
1	亞托敏	10	90	90
1	亞托敏	40	94	92
1	亞托敏	200	93	95
0	啞氧菌酯	10	0	
0	啞氧菌酯	40	0	
0	啞氧菌酯	200	0	
0.1	啞氧菌酯	10	0	3
0.1	啞氧菌酯	40	0	3
0.1	啞氧菌酯	200	0	3
1	啞氧菌酯	10	79	90
1	啞氧菌酯	40	70	90
1	啞氧菌酯	200	85	90
0	四克利	10	0	

化合物 81 之施用率 (ppm)	組分(b)	組分(b)之施用率 (ppm)	測試 M5	
			Obsd	Exp
0	四克利	40	7	
0	四克利	200	99	
0.1	四克利	10	13	3
0.1	四克利	40	60	10
0.1	四克利	200	99	99
1	四克利	10	87	90
1	四克利	40	99	91
1	四克利	200	100	100
0	萁孢菌素	10	0	
0	萁孢菌素	40	3	
0	萁孢菌素	200	0	
0.1	萁孢菌素	10	0	3
0.1	萁孢菌素	40	0	7
0.1	萁孢菌素	200	7	3
1	萁孢菌素	10	88	90
1	萁孢菌素	40	85	90
1	萁孢菌素	200	100	90
0	丙氧喹啉	10	0	
0	丙氧喹啉	40	0	
0	丙氧喹啉	200	0	
0.1	丙氧喹啉	10	0	3
0.1	丙氧喹啉	40	0	3
0.1	丙氧喹啉	200	0	3
1	丙氧喹啉	10	22	90
1	丙氧喹啉	40	55	90
1	丙氧喹啉	200	25	90

表 B 至 K 顯示包含一代表性式 1 化合物與各式組分(b)化合物之混合物的本發明組成物，在某些例子中會展現對小麥白粉病、葉鏽病與葉斑病之協同性防治效果。由於防治效果不能超過 100%，無法總是在混合物中觀測到大於期望殺真菌活性的增加活性，但更可能當分開活性成分組分單獨在提供相當顯著少於 100%防治效果之施用率時觀測到。在低施用率且個別活性成分單

獨具有低活性時，協同效果可能不明顯。然而，在某些例子中，對於其中個別活性成分在相同施用率下具有低活性或無活性之組成物，可觀測到更高的活性。如上所示，本發明提供一種用於防治白粉病(*Blumeria graminis* f. sp. *tritici*)、葉鏽病(*Puccinia recondita* f. sp. *tritici*)與小麥葉斑病(*Septoria tritici*)之方法。

測試 N1 與 N2

測試 N1 與 N2 涉及評估化合物 81 分別與 2-[(3-溴-8-甲基-6-喹啉基)氧基]-N-(1,1-二甲基-2-丙炔-1-基)-2-(甲硫基)乙醯胺(化合物 A1)及 2-[(3-溴-6-喹啉基)氧基]-N-(1,1-二甲基乙基)丁醯胺(化合物 A2)之混合物用於抑制小麥葉斑病(*Septoria tritici*)(小麥葉斑病的致病劑)之效果用於製備測試組成物之通用方法如下。化合物 81(測試 N1 與 N2)、化合物 A1(測試 N1)與化合物 A2(測試 N2)係獲得為未經配製，工業級材料。先將未經配製的測試化合物以合適濃度溶於 DMSO 中，以在與真菌生長介質混合後提供所欲濃度(以 μM 為單位)，該生長介質係在 96 孔盤之孔中，每孔含有 200 μL 的真菌生長介質。選擇化合物濃度範圍以使抑制活性有 0 至接近 100% 的變化範圍，而在以組合加入之化合物處理小麥葉斑病時能辨識出任何協同作用。將測試化合物之 DMSO 溶液加入至孔中，而後加入真菌生長介質。

藉由形成含有以下之混合物而製備真菌生長介質：磷酸氫二鉀(3.0 g/L)、磷酸二氫鉀(4.0 g/L)、氯化鈉(0.5 g/L)、氯化銨(1.0 g/L)、硫酸鎂七水合物(0.2 g)

與氯化鈣二水合物(0.01 g/L)，該混合物亦含有 1 mL/L 的微量元素溶液(硫酸錳水合物(0.1 mg/mL)、硫酸鋅七水合物(0.2 mg/mL)、硫酸銅(II)五水合物(0.2 mg/mL)、硫酸鐵(II)七水合物(0.2 mg/mL)、鉬酸鈉二水合物(0.1 mg/mL)、硫酸鈷(II)七水合物(0.06 mg/mL)、硼酸(0.08 mg/mL))，並以 50 μ L/L 的生物素儲備液(0.1 mg/mL)增補。以 1 M 碳酸鈉水溶液將 pH 調整為 6.8。進一步以 1 g/L 的酵母萃取物增補混合物，並將 GELRITE 結冷膠(Kelco) (4 g/L)加入。將足夠水加入以將體積增加至最終體積的 90% (例如 900 mL 體積以製備 1 L 的真菌生長介質)。將混合物高壓蒸氣滅菌。在冷卻至 60°C 時，將 100 mL/L 的右旋糖水溶液(10 g/L)、500 μ L/L 的安比西林水溶液(100 mg/mL)與 500 μ L/L 的利福平(rifampicin)溶液(10 mg/mL 於 DMSO 中)加入，以提供真菌生長介質的最終體積，而後在其溫熱時以微升吸量管將其分配至該 96 孔盤之孔中。使用該分液吸量管攪拌已分配在各孔中之真菌生長介質，以將其與含有測試化合物之 DMSO 溶液混合。

在孔中之真菌生長介質冷卻至室溫並固化後，將各孔中之生長介質上表面以 20 μ L 的真菌懸浮液(含有 8×10^4 細胞)接種。使其在無菌通風櫥中乾燥 2 小時期間後，接著將盤在 25°C 下置放於暗培養器中 5 天。

在一盤讀數器(設定為測量 600 nm 光之吸光度)上估算真菌生長。在測試 N1 與 N2 中測得之生長抑制百分比(Obsd.)，以及使用使用 Colby 等式計算得到之預期生長抑制百分比(Exp.)係分別列示於表 L 與 M 中。

表 L

化合物 81 單獨及其與作為組分(b)之化合物 A1 的混合物用
於防治小麥葉斑病的實測與預期效果

化合物 81 之施用率 (μM)	化合物 A1 之施用率 (μM)	%抑制	
		Obsd.	Exp.
0.2	0	98.0	
0.04	0	93.5	
0.008	0	10.0	
0.0016	0	5.0	
0.00032	0	9.0	
0	0	0	
0	0.2	98.0	
0	0.04	97	
0	0.008	14.5	
0	0.0016	5	
0	0.00032	3	
0	0	0	0
0.2	0.2	98	98
0.2	0.04	98	98
0.2	0.008	98	98
0.2	0.0016	98	98
0.2	0.00032	98	98
0.04	0.2	98	99.0
0.04	0.04	98	99.0
0.04	0.008	98	96.0
0.04	0.0016	94.2	94.0
0.04	0.00032	92	96.0
0.008	0.2	98.0	99.0
0.008	0.04	97.0	99.0
0.008	0.008	62.0	22.0
0.008	0.0016	6.0	14.0
0.008	0.00032	5.0	13.0
0.016	0.2	98.0	98.0
0.016	0.04	97.0	96.0
0.016	0.008	32.0	18.0
0.016	0.0016	5.0	10.0
0.016	0.00032	9.0	8.0
0.0032	0.2	98.0	97.0

104 年 6 月 8 日修正替換頁

化合物 81 之施用率 (μM)	化合物 A1 之施用率 (μM)	%抑制	
		Obsd.	Exp.
0.0032	0.04	94.0	96.0
0.0032	0.008	8.0	22.0
0.0032	0.0016	8.0	14.0
0.0032	0.00032	6.0	12.0

表 M

化合物 81 單獨及其與作為組分(b)之化合物 A2 的混合物用
於防治小麥葉斑病的實測與預期效果

化合物 81 之施用率 (μM)	化合物 A2 之施用率 (μM)	%抑制	
		Obsd.	Exp.
0.2	0	96.0	
0.04	0	93.5	
0.008	0	29.0	
0.0016	0	0.0	
0.00032	0	0.0	
0	0	0	
0	20	96.0	
0	4	95.0	
0	0.8	11.5	
0	0.16	6.5	
0	0.032	0.0	
0	0	0	
0.2	20	96	100
0.2	4	96	100
0.2	0.8	96	96
0.2	0.16	96	96
0.2	0.032	96	96
0.04	20	96.0	100
0.04	4	96.0	100
0.04	0.8	96.0	94.2
0.04	0.16	95.5	93.9
0.04	0.032	95.0	93.5
0.008	20	96.0	97.2
0.008	4	96.0	96.5
0.008	0.8	68.0	37.2
0.008	0.16	0.0	33.6

化合物 81 之施用率 (μM)	化合物 A2 之施用率 (μM)	%抑制	
		Obsd.	Exp.
0.008	0.032	0.0	29.0
0.016	20	96.0	96.0
0.016	4	96.0	95.0
0.016	0.8	46.5	11.5
0.016	0.16	6.5	6.5
0.016	0.032	0.0	0.0
0.0032	20	96.0	96.0
0.0032	4	95.0	95.0
0.0032	0.8	13.0	11.5
0.0032	0.16	24.5	6.5
0.0032	0.032	1.5	0.0

化合物 81 與化合物 A1 之混合物的實測與預期結果(在測試 N1 中且顯示於表 L 中)顯示大於預期之活性(即協同效果)，此係在化合物 81 與化合物 A1 分開提供遠低於 100%抑制效果的施用率下(以表現出抑制效果的協同性增加)，但亦在施用率相較於提供高抑制效果(由化合物 81 與化合物 A1 分開提供)的施用率未大幅降低的施用率下(例如 0.008 或 0.016 μM 的化合物 81 施用率與 0.008 μM 的化合物 A1 施用率)。同樣地，化合物 81 與化合物 A2 之混合物的實測與預期結果(在測試 N2 中且顯示於表 M 中)顯示大於預期之活性，此係在化合物 81 與化合物 A2 分開提供遠低於 100%抑制效果的施用率下，但亦在施用率相較於提供高抑制效果(由化合物 81 與化合物 A2 分開提供)的施用率未大幅降低的施用率下(例如 0.008 或 0.016 μM 的化合物 81 施用率與 0.008 μM 的化合物 A2 施用率)。

【圖式簡單說明】

無

【主要元件符號說明】

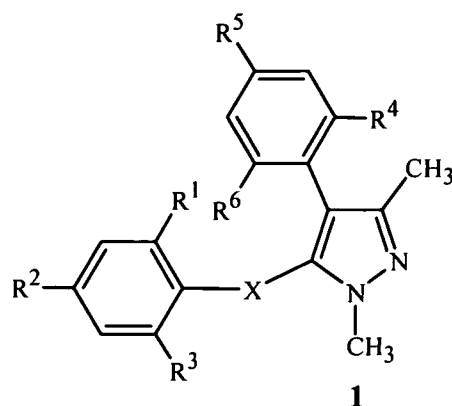
無

104 年 6 月 8 日
修正本

七、申請專利範圍：

1. 一種殺真菌組成物，其包含：

(a) 至少一種選自式 1 化合物、其 *N*-氧化物及其鹽之化合物：



其中

X 為 NH；

R^1 為鹵素；

R^2 為 H；

R^3 為鹵素；

R^4 為鹵素；

R^5 為 H、氰基、鹵素或 C_1 - C_2 烷氧基；以及

R^6 為 H 或鹵素；以及

(b) 至少一種額外的殺真菌化合物；

其限制條件是當 R^1 為 F，則 R^3 為 Cl；而當 R^1 為 Cl，則 R^3 為 F。

2. 如請求項 1 所述之組成物，其中組分(a)包含一式 1 化合物或其鹽，其中在式 1 中，

R^2 與 R^3 最多只有其中一者為 H；以及
 R^5 與 R^6 最多只有其中一者為 H。

3. 如請求項 2 所述之組成物，其中在式 1 中，

R^1 為 F、Cl 或 Br；

R^2 為 H；

R^3 為 F 或 Cl；

R^4 為 F、Cl 或 Br；

R^5 為 H、氰基、F、Cl 或甲氧基；以及

R^6 為 H 或 F。

4. 如請求項 3 所述之組成物，其中在式 1 中，

R^3 為 F；以及

R^5 為氰基、F、Cl 或甲氧基。

5. 如請求項 1 所述之組成物，其中組分(a)包含一選自由以下
所組成之群組的化合物：

4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-
吡唑-5-胺、

4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-
吡唑-5-胺、

N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-
吡唑-5-胺、

4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-
吡唑-5-胺、

N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺、

N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺、

N-(2-氯-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺、

N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺、

N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺，以及

N-(2-氯-6-氟苯基)-4-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺。

6. 如請求項 1 至 5 其中任一項所述之組成物，其中組分(b)包括至少一種選自由以下所組成之群組的殺真菌化合物：

- (b1) 苯并咪唑胺甲酸甲酯類殺真菌劑；
- (b2) 二羧醯亞胺類(dicarboximide)殺真菌劑；
- (b3) 去甲基作用抑制劑類殺真菌劑；
- (b4) 苯醯胺類殺真菌劑；
- (b5) 胺/嗎啉(amine/morpholine)類殺真菌劑；
- (b6) 磷脂質生合成抑制劑類殺真菌劑；
- (b7) 羧醯胺類(carboxamide)殺真菌劑；
- (b8) 羥基(2-胺基-)嘧啶類殺真菌劑；
- (b9) 苯胺嘧啶類殺真菌劑；
- (b10) *N*-苯基胺基甲酸酯類殺真菌劑；
- (b11) 醌外抑制劑類殺真菌劑；

- (b12) 苯基吡咯類殺真菌劑；
- (b13) 喹啉類殺真菌劑；
- (b14) 脂質過氧化抑制劑類殺真菌劑；
- (b15) 黑色素生合成抑制劑-還原酶類殺真菌劑；
- (b16) 黑色素生合成抑制劑-脫水酶類殺真菌劑；
- (b17) 羥基苯胺類殺真菌劑；
- (b18) 鯊烯-環氧酶抑制劑類殺真菌劑；
- (b19) 多氧菌素類(polyoxin)殺真菌劑；
- (b20) 苯脲類殺真菌劑；
- (b21) 醌內抑制劑類殺真菌劑；
- (b22) 苯甲醯胺類殺真菌劑；
- (b23) 哌喃糖醛酸(enopyranuronic acid)抗生素類殺真菌劑；
- (b24) 六碳糖哌喃糖苷基(hexopyranosyl)抗生素類殺真菌劑；
- (b25) 葡萄糖哌喃糖苷基(glucopyranosyl)抗生素：蛋白質合成類殺真菌劑；
- (b26) 葡萄糖哌喃糖苷基抗生素：繭蜜糖酶及肌醇生合成殺真菌劑；
- (b27) 氰乙醯胺肟類(cyanoacetamideoxime)殺真菌劑；
- (b28) 胺基甲酸酯類殺真菌劑；
- (b29) 氧化磷酸化解偶合類殺真菌劑；
- (b30) 有機錫類殺真菌劑；
- (b31) 羧酸類殺真菌劑；
- (b32) 雜芳香族類殺真菌劑；
- (b33) 膦酸鹽類殺真菌劑；

- (b34) 鄰胺甲醯苯甲酸類殺真菌劑；
- (b35) 苯并三吡(benzotriazine)殺真菌劑；
- (b36) 苯-磺醯胺類殺真菌劑；
- (b37) 吡啶酮類(pyridazinone)殺真菌劑；
- (b38) 噻吩-羧醯胺類殺真菌劑；
- (b39) 嘧啶醯胺類殺真菌劑；
- (b40) 羧酸醯胺類殺真菌劑；
- (b41) 四環素類抗生素殺真菌劑；
- (b42) 硫胺甲酸酯類殺真菌劑；
- (b43) 苯甲醯胺類殺真菌劑；
- (b44) 誘發寄主植物防禦類殺真菌劑；
- (b45) 多重位點接觸活性類殺真菌劑；
- (b46) 非組分(a)及組分(b1)至(b45)殺真菌化合物之殺真菌化合物；以及組分(b1)至(b46)化合物之鹽。

7. 如請求項 6 所述之組成物，其中組分(b)包含至少一種殺真菌化合物，該殺真菌化合物來自選自(b1)至(b46)之兩個不同群組的各個群組。

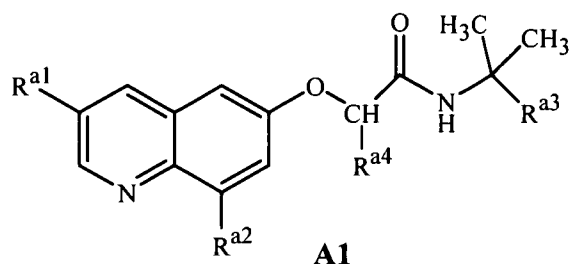
8. 如請求項 1 所述之組成物，其中組分(b)包含至少一種選自以下之化合物：阿拉酸式苯-S-甲基、愛地福、辛唑嘧菌胺、安美速、敵菌靈、阿扎康唑、亞托敏、本達樂、右本達樂、麥鏽靈、免賴得、苯噻菌胺、苯噻菌胺-異丙基、比托沙、百蟎克、聯苯、比多農、必殺芬、保米黴素、白克列、溴克座、布瑞莫、萎鏽靈、加普胺、四氯丹、蓋普丹、貝芬替、二氯甲氧苯、四氯異苯腈、克氣得、克霉唑、銅鹽、

賽座滅、賽芬胺、克絕、環克座、賽普洛、益發靈、雙氯
菌胺、達滅淨、大克爛、乙霉威、待克利、二氟林、二
甲依瑞莫、達滅芬、醚菌胺、達克利、達克利-M、白粉克、
腈硫醌、十二環嗎啉、多寧、護粒松、烯肟菌酯、依普座、
噻唑菌胺、依瑞莫、依得利、凡殺同、咪唑菌酮、芬瑞莫、
芬克座、甲呋醯胺、環醯菌胺、芬諾尼、拌種咯、苯鏽啖、
芬普福、胺苯吡菌酮、三苯醋錫、三苯氯錫、三苯羥錫、
富爾邦、富米綜、扶吉胺、護汰寧、氟醯菌胺、氟嗎啉、
氟比來、氟吡菌醯胺、氟里醚、氟嘧菌酯、氟喹唑、護砂
得、氟硫滅、氟噻菌淨、福多寧、護汰芬、福熱殺
(fluxapyroxad)、福爾培、福賽得、麥穗寧、呋霜靈、福拉
比、菲克利、殺紋寧、克熱淨、依滅列、易胺座、克熱淨、
愛得寶、種菌唑、丙基喜樂松、依普同、丙森鋅、亞賜圃、
異吡聯(isopyrazam)、異噻菌胺、嘉賜黴素、克收欣、鋅
錳乃浦、曼普胺、錳乃浦、滅普寧、氧乙酸基白粉克、滅
達樂、滅達樂-M、滅特座、滅速克、免得爛、苯氧菌胺、
滅派林、滅芬農、邁克尼、納芙迪芬、新阿蘇仁(鐵甲砷
酸銨)、尼瑞莫、辛噻酮、呋醯胺、肟醚菌胺、毆殺斯、
歐索林酸、惡咪唑、嘉保信、氧四環素、平克座、賓克隆、
派福芬、吡噻菌胺、披扶座、亞磷酸及其鹽、熱必斯、啖
氧菌酯、粉病靈、多氧菌素、撲殺熱、撲克拉、撲滅寧、
普拔克、普拔克-鹽酸鹽、普克利、甲基鋅乃浦、丙氧喹
啉、胺丙威、丙硫菌唑、百克敏、唑胺菌酯、唑菌酯、白
粉松、防霉丹、稗草畏、比芬諾、派美尼、派芬農、百快
隆、吡咯菌素、滅蟎蟻、快諾芬、五氯硝苯、環丙吡菌胺、
砂噻菌胺、砂氟唑、萁孢菌素、鏈黴素、硫、得克利、泰

伏勤、克枯爛、四氯硝基苯、特比萘酚、四克利、腐絕、
 賽氣滅、多保淨、甲基多保淨、得恩地、噻噠菌胺、脫克
 松、甲基益發靈、三泰芬、三泰隆、咪唑嗪、三賽唑、三
 得芬、賽福座、三賽唑、三氟敏、賽福寧、三芬噠胺、滅
 菌唑、單克素、維利黴素、瓦芬耐、免克寧、鋅乃浦、福
 美鋅、座賽胺、*N'*-[4-[4-氯-3-(三氟甲基)苯氧基]-2,5-二甲
 苯基]-*N*-乙基-*N*-甲基甲噠亞胺噠胺、5-氯-6-(2,4,6-三氟苯
 基)-7-(4-甲哌啶-1-基)[1,2,4]三唑并[1,5-*a*]嘧啶、
N-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧基]-3-甲氧苯基]乙
 基]-3-甲基-2-[(甲磺噠基)胺基]丁噠胺、*N*-[2-[4-[[3-(4-氯
 苯基)-2-丙炔-1-基]氧基]-3-甲氧苯基]乙基]-3-甲基-2-[(乙
 磺噠基)胺基]丁噠胺、2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4*H*-1-苯并哌
 喃-4-酮、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基-3-異噁唑啶基]吡啶、
N-[1-[[[1-(4-氯苯基)乙基]磺噠基]甲基]丙基]胺基甲酸 4-
 氯苯酯、*N*-[[[(環丙甲氧基)胺基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氯
 苯基]亞甲基]苯乙噠胺、 α -(甲氧亞胺基)-*N*-甲基
 -2-[[[1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基]亞胺基]甲基]苯乙噠
 胺、*N'*-[4-[4-氯-3-(三氟甲基)苯氧基]-2,5-二甲苯基]-*N*-乙
 基-*N*-甲基甲噠亞胺噠胺、*N*-(4-氯-2-硝苯基)-*N*-乙基-4-甲
 苯磺噠胺、2-[[[3-(2,6-二氯苯基)-1-甲基-2-丙烯-1-亞基]
 胺基]氧基]甲基]- α -(甲氧亞胺基)-*N*-甲苯乙噠胺、1-[(2-丙
 烯硫基)羰基]-2-(1-甲基乙基)-4-(2-甲苯基)-5-胺-1*H*-吡唑
 -3-酮、5-乙基-6-辛基-[1,2,4]三唑并[1,5-*a*]嘧啶-7-基胺、
N-[4-[[[(1-甲基-1*H*-四唑-5-基)苯亞甲基]胺基]氧基]甲
 基]-2-噻唑基]胺基甲酸戊酯與 *N*-[6-[[[(1-甲基-1*H*-四唑

-5-基)苯亞甲基]胺基]氧基]甲基]-2-吡啶基]胺基甲酸戊酯。

9. 如請求項 1 所述之組成物，其中組分(b)包括至少一種選自式 A1 及其鹽之殺真菌化合物



其中

R^{a1} 為鹵素、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 炔基；

R^{a2} 為 H、鹵素或 C_1-C_4 烷基；

R^{a3} 為 C_1-C_{12} 烷基、 C_1-C_{12} 鹵烷基、 C_1-C_{12} 烷氧基、 C_2-C_{12} 烷氧烷基、 C_2-C_{12} 烯基、 C_2-C_{12} 炔基、 C_4-C_{12} 烷氧烯基、 C_4-C_{12} 烷氧炔基、 C_1-C_{12} 烷硫基或 C_2-C_{12} 烷硫烷基；

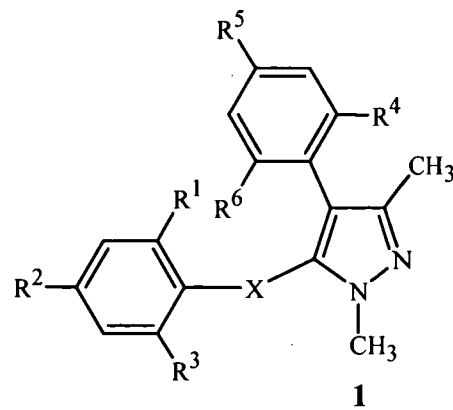
R^{a4} 為甲基或 $Y^{a1}-R^{a5}$ ；

R^{a5} 為 C_1-C_2 烷基；以及

Y^{a1} 為 CH_2 、O 或 S。

10. 一種組成物，其包含：(a)至少一種選自如請求項 1 所定義之式 1 化合物、其 *N*-氧化物及其鹽的化合物；以及至少一種無脊椎害蟲防治化合物或藥劑。

11. 一種組成物，其包含請求項 1 至 10 其中任一項之組成物與至少一種選自由表面活性劑、固體稀釋劑與液體稀釋劑所組成之群組的額外組分。
12. 一種用於保護一植物或植物種子免於感染由真菌類病原體造成之病害的方法，該方法包含施予一殺真菌有效量之請求項 1 至 11 其中任一項的組成物至該植物或植物種子。
13. 一種用於保護植物免於感染白粉病的方法，其包含施予該植物一殺真菌有效量之請求項 1 至 5 其中任一項的組成物，其中組分(b)包括至少一種選自(b11)醌外抑制劑類殺真菌劑之殺真菌化合物。
14. 一種用於保護植物免於感染葉枯病(*Septoria* disease)的方法，其包含施予該植物一殺真菌有效量之請求項 9 的組成物。
15. 一種式 1 化合物或一種其 *N*-氧化物或其鹽，



其中

X 為 NH；

R¹ 為鹵素；

R² 為 H；

R³ 為鹵素；

R⁴ 為鹵素；

R⁵ 為 H、氰基、鹵素或 C₁-C₂ 烷氧基；以及

R⁶ 為 H 或鹵素；

其限制條件是當 R¹ 為 F，則 R³ 為 Cl，而當 R¹ 為 Cl，則 R³ 為 F。

16. 如請求項 15 所述之化合物，其中

R³ 為 F 或 Cl。

17. 如請求項 16 所述之化合物，其中

R¹ 為 Cl 或 Br；以及

R³ 為 F。

18. 如請求項 15 所述之化合物，其係選自由以下所組成之群組：

4-(2-氯-4-氟苯基)-*N*-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺、

4-(2-溴-4-氟苯基)-*N*-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺，以及

N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺。

19. 一種殺真菌組成物，其包含：(1)一請求項 15 至 18 其中任一項之化合物；以及(2)至少一種選自由表面活性劑、固體稀釋劑以及液體稀釋劑所組成之群組的額外組分。

20. 一種用於保護植物或植物種子免於感染由真菌類病原體造成之病害的方法，該方法包含施予一殺真菌有效量之請求項 15 至 18 其中任一項的化合物至該植物或植物種子。

21. 如請求項 1 所述之組成物，其中組分(a)為 4-(2-溴-4-氟苯基)-*N*-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺。

22. 如請求項 15 所述之化合物，係為 4-(2-溴-4-氟苯基)-*N*-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺。

23. 如請求項 1 所述之組成物，其中組分(a)為 4-(2-溴-4-氟苯基)-*N*-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-胺；且組份(b)包括至少一種選自亞托敏、克收欣、三氟敏、百克

敏、唑菌酯、唑胺菌酯、啉氧菌酯、醚菌胺、苯氧菌胺、貝芬替、四氯異苯腈、快諾芬、滅芬農、派芬農、賽芬胺、苯鏽啉、芬普福、溴克座、環克座、待克利、依普座、芬克座、護矽得、菲克利、種菌唑、滅特座、邁克尼、平克座、普克利、丙氧喹啉、丙硫菌唑、得克利、滅菌唑、凡殺同、撲克拉、吡噻菌胺及白克列的化合物。

24. 如請求項 1 或 23 所述之組成物，其中組分(b)包括至少一種選自四氯異苯腈、滅特座、丙硫菌唑及吡噻菌胺的化合物。