

發明專利說明書 200306782

(填寫本書件時請先行詳閱申請書後之申請須知，作※記號部分請勿填寫)

※ 申請案號： 92105641 ※IPC 分類： A01N37/18
※ 申請日期： 92.3.14

壹、發明名稱

(中文) 作為殺菌劑之吡啶鹽胺及其有用之組合物
(英文) PYRIDINYL AMIDES AND ADVANTAGEOUS COMPOSITIONS
THEREOF FOR USE AS FUNGICIDES

貳、發明人 (共 2 人)

發明人 1 (如發明人超過一人，請填說明書發明人續頁)

姓名：(中文) 史帝芬 雷 佛爾
(英文) STEPHEN RAY FOOR

住居所地址：(中文) 美國德來懷州赫金森市海明威路 508 號
(英文) 508 HEMINGWAY DRIVE, HOCKESSIN,
DELAWARE 19707, U.S.A.

國籍：(中文) 美國 (英文) U.S.A.

參、申請人 (共 1 人)

申請人 1 (如申請人超過一人，請填說明書申請人續頁)

姓名或名稱：(中文) 美商杜邦股份有限公司
(英文) E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY

住居所或營業所地址：(中文) 美國德來懷州威明頓市馬卡第街 1007 號
(英文) 1007 MARKET STREET, WILMINGTON,
DELAWARE 19898, U.S.A.

國籍：(中文) 美國 (英文) U.S.A.

代表人：(中文) 馬瑞安 迪 麥克奈海
(英文) MIRIAM D. MECONNAHEY

發明人 2

姓名：(中文) 邁可 保羅 沃克

(英文) MICHAEL PAUL WALKER

住居所地址：(中文) 美國賓州藍登堡市湯普森路 137 號

(英文) 137 THOMPSON CIRCLE, LANDENBERG,

PENNSYLVANIA 19350, U.S.A.

國籍：(中文) 美國 (英文) U.S.A.

捌、聲明事項

☐ 本案係符合專利法第二十條第一項 ☐ 第一款但書或 ☐ 第二款但書規定之期間，其日期為：_____

☒ 本案已向下列國家（地區）申請專利，申請日期及案號資料如下：

[格式請依：申請國家（地區）；申請日期；申請案號 順序註記]

1. 美國；2002 年 03 月 19 日；60/365,765

2. _____

3. _____

☒ 主張專利法第二十四條第一項優先權：

[格式請依：受理國家（地區）；日期；案號 順序註記]

1. 美國；2002 年 03 月 19 日；60/365,765

2. _____

3. _____

4. _____

5. _____

6. _____

7. _____

8. _____

9. _____

10. _____

☐ 主張專利法第二十五條之一第一項優先權：

[格式請依：申請日；申請案號 順序註記]

1. _____

2. _____

3. _____

☐ 主張專利法第二十六條微生物：

☐ 國內微生物 [格式請依：寄存機構；日期；號碼 順序註記]

1. _____

2. _____

3. _____

☐ 國外微生物 [格式請依：寄存國名；機構；日期；號碼 順序註記]

1. _____

2. _____

3. _____

☐ 熟習該項技術者易於獲得，不須寄存。

(1)

玖、發明說明

(發明說明應敘明：發明所屬之技術領域、先前技術、內容、實施方式及圖式簡單說明)

技術領域

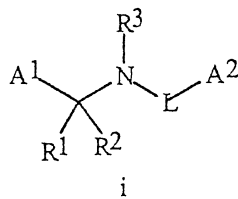
本發明係關於某些吡啶醯胺、其N-氧化物、農業上適當之鹽，某些含吡啶醯胺及其他殺真菌劑的混合物之有利組合物，及其作為殺真菌劑用途之方法。

先前技術

為達成高收成效率，控制真菌性之植物病原造成的植物疾病是很重要的。會傷害觀賞植物、蔬菜、田野、穀類與水果作物之植物疾病會顯著降低產量並造成消費者成本增加。儘管，為此目的已有很多市售產品，但對更有效、較便宜、毒性較低或環保上較安全的新產品之需求繼續存在。

WO 01/11966 揭示某些作為殺真菌劑之式 I 之吡啶醯胺

其中



A¹為經可達四個基取代之2-吡啶

基，其中至少一個為鹵烷基，

A²為經視情形取代之雜芳環基，

R¹與R²為獨立之H、烷基或醯基，

R³為H或烷基，而

L為 -(C=O)-、-SO₂- 或 -(C=S)-。

農民一直需要可有效控制植物真菌，尤其是諸如疫菌屬與葡萄露菌屬之卵菌綱的殺真菌劑。為促進疾病控制並延遲抗藥性之發生，通常使用殺真菌劑之組合。所需要的是利用可提供對植物病原具治療、系統性與預防性控制之活

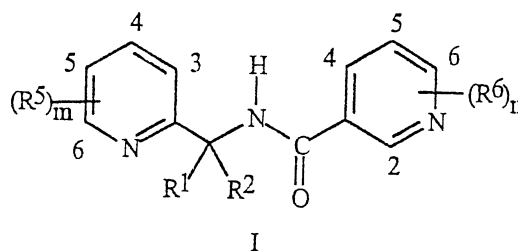
性成分的混合物，以增強活性範圍與控制疾病之效率。亦需要可提供較大殘留量控制以允許較長噴灑間隔之組合。也非常需要結合能抑制真菌病原之不同生化路徑，以延遲對任何特定植物疾病之控制劑發生抗藥性的殺真菌劑。

對所有情形皆特別有利的是能減少化學藥劑於環境之釋放量並確保作物免於植物病原造成的疾病之侵擾。殺真菌劑之混合物與根據個別成份之活性比較，可能提供明顯較好之疾病控制。有人描述此增效性為"混合物之兩種成份的合作作用，使總效果比兩個(或更多)獨立使用者的效果總合更大或更長"(參照 Tames, P.M.L., Neth. J. Plant Pathology, (1964), 70, 73-80)。

人們期望找出可達成前述一或多種目標之殺真菌劑。

發明內容

本發明提供控制真菌性之植物病原造成的植物疾病之組合物，包括(a)至少一種式I化合物(包括全部幾何與立體異構物)，其N-氧化物與農業上適當的鹽。



其中

R^1 與 R^2 各自獨立為H或 C_1-C_6 烷基，

每個 R^5 獨立為 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 鹵炔基、 C_3-C_6 鹵環烷基、鹵素、CN、

(3)

CO₂H、CONH₂、NO₂、羥基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄烷亞硫鹽基、C₁-C₄烷磺鹽基、C₁-C₄鹵烷硫基、C₁-C₄鹵烷亞硫鹽基、C₁-C₄鹵烷磺鹽基、C₁-C₄烷胺基、C₂-C₈二烷胺基、C₃-C₆環烷胺基、C₂-C₆烷羧基、C₂-C₆烷氧羧基、C₂-C₆烷胺羧基、C₃-C₈二烷胺羧基或C₃-C₆三烷矽烷基，

每個R⁶獨立為C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₆環烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₂-C₆鹵烯基、C₂-C₆鹵炔基、C₃-C₆鹵環烷基、鹵素、CN、CO₂H、CONH₂、NO₂、羥基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄烷亞硫鹽基、C₁-C₄烷磺鹽基、C₁-C₄鹵烷硫基、C₁-C₄鹵烷亞硫鹽基、C₁-C₄鹵烷磺鹽基、C₁-C₄烷胺基、C₂-C₈二烷胺基、C₃-C₆環烷胺基、C₂-C₆烷羧基、C₂-C₆烷氧羧基、C₂-C₆烷胺羧基、C₃-C₈二烷胺羧基、C₃-C₆三烷矽烷基，而

m與n係獨立之1、2、3或4，以及

(b)至少一種化合物係選自由下列各物組成者：

(b1)伸烷基雙(二硫代胺基甲酸鹽)殺真菌劑，

(b2)作用於真菌粒線體呼吸電子傳遞位置之bc₁複合體的化合物，

(b3)克絕，

(b4)作用於固醇生化合成代謝路徑之去甲基酶的化合物，

(b5)作用於固醇生化合成代謝路徑之嗎福啉與哌啶化合物，

(b6)苯醌胺殺真菌劑，

(4)

(b7) 嘧啶酮殺真菌劑，

(b8) 鄰苯二甲醯亞胺與

(b9) 福賽得。

本發明亦有關其中至少一個 R^6 為碘之式 I 化合物。

本發明亦有關控制由真菌性植物病原造成的植物疾病之方法，包括施予植物或其部份或植物種子或幼苗有效量之本發明化合物或組合物。

實施方式

在上述列舉中，"烷基"之用語若非單獨使用，即是成為複合字如"烷硫基"或"鹵烷基"包括直鏈或支鏈烷基，諸如甲基、乙基、正-丙基、異-丙基或不同之丁基、戊基或己基異構物。"烯基"包括直鏈或支鏈烯基，諸如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基與不同之丁烯基、戊烯基或己烯基異構物。"烯基"亦包括諸如 1,2-丙二烯與 2,4-己二烯之多烯類。"炔基"包括直鏈或支鏈炔基，諸如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基與不同之丁炔基、戊炔基或己炔基異構物。"炔基"亦包括多元三鍵諸如 2,5-己二炔部分。"烷氧基"包括例如，甲氧基、乙氧基、正-丙氧基、異-丙氧基與不同之丁氧基、戊氧基或己氧基異構物。"烷氧烷基"意指烷基上有烷氧取代基者。"烷氧烷基"之實例包括 CH_3OCH_2 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 與 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 。"烷氧烷氧基"意指烷氧基上有烷氧取代基者。"烯氧基"之用語包括直鏈或支鏈烯氧基部分。"烯氧基"之實例包括 $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、

(5)

$(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}$ 與 $\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 。"炔氧基"包括直鏈或支鏈炔氧基部分。"炔氧基"之實例包括 $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ 、 $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ 與 $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 。"烷硫基"包括支鏈或直鏈烷硫基部分，諸如甲硫基、乙硫基與不同之丙硫基、丁硫基、戊硫基與己硫基異構物。"烷硫烷基"意指烷基上有烷硫基取代基。"烷硫基"之實例包括 CH_3SCH_2 、 $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 與 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 。"烷硫烷氧基"意指烷氧基上有烷硫基取代基。"烷亞硫鹽基"包括烷亞硫鹽基之兩種對掌物。"烷亞硫鹽基"之實例包括 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})$ 與不同之丁基亞硫鹽基、戊基亞硫鹽基與己基亞硫鹽基異構物。"烷磺鹽基"之實例包括 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2$ 與不同之丁基磺鹽基、戊基磺鹽基與己基磺鹽基異構物。"烷胺基"、"二烷胺基"、"烯硫基"、"烯亞硫鹽基"、"烯磺鹽基"、"炔硫基"、"炔亞硫鹽基"、"炔磺鹽基"及其類似物之定義係類似上述實例者。"環烷基"包括例如環丙基、環丁基、環戊基與環己基等。"環烷氧基"之用語包括經由氧原子連接之相同的基，諸如環戊氧基與環己氧基等。

"鹵素"之用語若非單獨即是以諸如"鹵烷基"之複合字出現，包括氟、氯、溴或碘。甚且，當以諸如"鹵烷基"之複合字出現時，該烷基得為部份或完全經相同或不同之鹵原子取代之烷基。"鹵烷基"之實例包括 F_3C 、 ClCH_2 、 CF_3CH_2 與 CF_3CCl_2 。"鹵烯基"、"鹵炔基"、"鹵烷氧基"、"鹵烷硫基"

及其類似物之用語的定義係類似鹵烷基者。"鹵烯基"之實例包括 $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2$ 與 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$ 。"鹵炔基"之實例包括 $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}$ 、 $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}$ 、 $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}$ 與 $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2$ 。"鹵烷氧基"之實例包括 CF_3O 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 與 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ 。"鹵烷硫基"之實例包括 CCl_3S 、 CF_3S 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}$ 與 $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}$ 。"鹵烷亞硫鹽基"之實例包括 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ 與 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})$ 。"鹵烷磺鹽基"之實例包括 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ 與 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2$ 。"鹵烷氧烷氧基"之實例包括 $\text{CF}_3\text{OCH}_2\text{O}$ 、 $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 與 $\text{Cl}_3\text{CCH}_2\text{OCH}_2\text{O}$ 以及支鏈烷基衍生物。"烷羰基"之實例包括 $\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、與 $\text{C}(\text{O})\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 。"烷氧羰基"之實例包括 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ 與 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})$ 與不同之丁氧羰基或戊氧羰基異構物。

熟諳此藝者會了解，因為氮需要得到單獨對的電子才能氧化成氧化物，故並非所有含雜環之氮皆能形成N-氧化物；熟諳此藝者會明瞭能形成N-氧化物含雜環之氮。熟諳此藝者亦可明瞭三級胺可形成氮氧化物。製備雜環與三級胺之N-氧化物的合成法係熟諳此藝者所熟知的，包括雜環與三級胺與諸如過乙酸與鄰-氯過苯酸之過氧酸、過氧化氫、諸如過氧化氫第三-丁酯之過氧化氫烷基、過硼酸鈉與諸如二甲基二環氧乙烷之二環氧乙烷之氧化作用。這些氮氧化物之製法在文獻中皆有詳細說明與回顧，其例參照：T.L. Gilchrist之Comprehensive Organic Synthesis，第7卷，748-750頁，S. V. Ley, 編者；Pergamon Press；M. Tisler與B. Stanovnik, 之

Comprehensive Heterocyclic Chemistry, 第3卷, 18-20頁, A. J. Boulton 與 A. McKillop, 編者; Pergamon Press; M. R. Grimmet 與 B. R. T. Keene 之 Advances in Heterocyclic Chemistry, 第43卷, 149-161頁, A. R. Katritzky, 編者; Academic Press; M. Tisler 與 B. Stanovnik 之 Advances in Heterocyclic Chemistry, 第9卷, 285-291頁, A. R. Katritzky 與 A. J. Boulton, 編者; Academic Press 以及 G. W. H. Cheeseman 與 E. S. G. Werstiuk 之 Advances in Heterocyclic Chemistry, 第22卷, 390-392頁, A. R. Katritzky 與 A. J. Boulton, 編者; Academic Press。

取代基中碳原子總數係以 " C_i-C_j " 字首表示, 其中 i 與 j 為 1~8 之整數。例如 C_1-C_3 烷磺醯基意指甲烷磺醯基至丙烷磺醯基, C_2 烷氧烷基意指 CH_3OCH_2 , C_3 烷氧烷基意指, 例如 $CH_3CH(OCH_3)$, $CH_3OCH_2CH_2$ 或 $CH_3CH_2OCH_2$, 而 C_4 烷氧烷基意指經總數含達4個碳原子之烷氧基取代之烷基的不同異構物, 其例包括 $CH_3CH_2CH_2OCH_2$ 與 $CH_3CH_2OCH_2CH_2$ 。

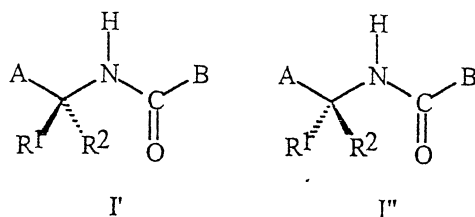
當某化合物經帶有意指該取代基的數目得超過一之下標數字的取代基取代時, 該取代基(當超過1時)係獨立地選自經定義的取代基。甚且, 當該下標字顯示一個範圍, 例如 $(R)_{i,j}$ 時, 則取代基之數目得為選自包括 i 、 j 及 i 與 j 間之任何整數。"視情形經一至三個取代基取代"之用語及其類似者, 意指此基上有一至三個可得位置可能被取代。

當某個基含得為氫之取代基, 例如 R^1 或 R^2 時, 則當該取代基為氫時, 我們即認為該基相當於未經取代。

式 I 化合物得存在一或多種立體異構物。不同的立體異構物包括對掌物、非對掌物、迴轉障礙異構物與幾何異構

物。熟諳此藝者會了解立體異構物可能更活潑，且/或當相對於其他立體異構物做過提煉或當與其他立體異構物分離時，會展現有利效果。此外，熟練的技術人員了解如何分離、提煉與/或選擇性製備該立體異構物。據此，本發明包括選自式I之化合物、其N-氧化物及農業上適當之鹽類。式I化合物得存在立體異構物之混合物、個別之立體異構物或光活性型式。特別是，當式I之 R^1 與 R^2 不同時，則該式子在 R^1 與 R^2 一般鍵結的碳原子上具有對掌中心。

本發明包括等量之式I'與式I''的消旋混合物。



其中A為經 $(R^5)_m$ 取代之2-吡啶基而B為經 $(R^6)_n$ 取代之3-吡啶基，至於 R^5 、 R^6 、m與n之定義係如上述。

此外，與式I'或式I''之對掌物的消旋混合物比較，本發明包括經提煉之化合物與組合物。本發明包括牽涉實質上純的式I'或式I''之對掌物的化合物與組合物。例如，與式I'的對掌物之消懸混合物比較，本發明亦包括經提煉之其中至少一個 R^6 為碘之式I化合物。本發明亦包括實質上純的式I'之對掌物。本發明亦包括與消懸混合物比較，其成分(a)係經式I'成分(a)之對掌物提煉之組合物。本發明亦包括與式I''之對掌物中的消懸混合物比較，係經提煉之其中至少一個 R^6 為碘之式I化合物。本發明亦包括實質上純的式I''之對掌

(9)

物。與消旋混合物比較，本發明亦包括其成分(a)係式I'之成分(a)的對掌物所提煉之組合物。

當對掌物經過提煉後，某對掌物的量會比另一個高，而提煉的程度得定義為對掌物過量("ee")之表示方式，其定義為 $100(2x-1)$ ，其中 x 為對掌物混合物中佔優勢之對掌物之莫耳分數(例如，ee20%相當於對掌物比為60:40)。

相對於 R^1 、 R^2 、A與經由氮鍵結之分子的其他部分之相對位置更為活潑的對掌物，相當於在 $CDCl_3$ 之溶液中，可旋轉平面偏極化光於(+)或右旋方向的對掌物之組態，

對掌物過量以至少50%較佳，以至少75%對掌物過量更佳，以至少90%對掌物過量益佳，以式I化合物之更活性異構物至少94%對掌物過量最佳。特別重要的是，式I之更活潑異構物之對掌上純的具體實施例。

式I化合物之鹽類包括與諸如氫溴酸、氫氯酸、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、柳酸、酒石酸、4-甲苯磺酸或戊酸等有機酸或無機酸之酸加成鹽。式I化合物若包括諸如羧酸或酚之酸性基時，其鹽類亦包括與有機鹼(例如吡啶、氨或三乙胺)或無機鹼(例如鈉、鉀、鋰、鈣、鎂或鋇之氫化物、氫氧化物或碳酸鹽)形成者。

為了較佳活性且/或較易合成之原因，其中(a)包括式I化合物之本發明的較佳組合物為：

較佳之1。較佳者為其組合物之式I至少有一與 $C=O$ 為鄰的連接位置之 R^6 。

較佳之2。較佳的1之組合物，其中每個與C=O為鄰的位置連接一個R⁶，並視情形有1至2個額外的R⁶且R⁶若不是鹵素即是甲基。

重要的是其中至少有一個R⁶為碘之組合物。

較佳之3。較佳之2的組合物，其中有一R⁶係位於2-位置與C=O為鄰的連接之Cl，另一R⁶係選自氯或甲基並位於4-位置與C=O為鄰的連接而第3個視情形之R⁶為位於第6個位置之甲基。

應注意的是其中R⁵為Cl、Br、I、CH₃、OCF₃、OCHF₂、OCH₂CF₃、OCF₂CF₃、OCF₂CF₂H、OCHF₂CF₃、SCF₃、SCHF₂、SCH₂CF₃、SCF₂CF₃、SCF₂CF₂H、SCH₂CF₃、SOCF₃、SOCHF₂、SOCH₂CF₃、SOCF₂CF₃、SOCF₂CF₂H、SOCHF₂CF₃、SO₂CF₃、SO₂CHF₂、SO₂CH₂CF₃、SO₂CF₂CF₃、SO₂CF₂CF₂H或SO₂CH₂CF₃。

本發明之較佳組合物包括，其中一個R⁵為第3位置之鹵素，而第二個R⁵為第5位置之鹵素或C₁-C₆鹵烷氧基之較佳的1到較佳的3。重要的是包括經至少一個做為R⁵之碘取代之式I化合物之組合物。

本發明之較佳組合物包括其中R¹為H而R²為H或CH₃之較佳的1到較佳的3。更佳者係其中R¹為H而R²為CH₃之較佳的1到較佳的3之組合物。

特佳者係包括選自下列化合物之組合物：

2,4-二氯-N-[(3,5-二氯-2-吡啶基)甲基]-3-吡啶羧醯胺，

2,4-二氯-N-[1-(3,5-二氯-2-吡啶基)乙基]-3-吡啶羧醯胺，

2,4-二氯-N-[(3,5-二氯-2-吡啶基)甲基]-6-甲基-3-吡啶羧醯

胺，

2,4-二氯-N-[1-(3,5-二氯-2-吡啶基)乙基]-6-甲基-3-吡啶羧醯胺，

N-[(5-溴-3-氯-2-吡啶基)甲基]-2,4-二氯-3-吡啶羧醯胺，

N-[1-(5-溴-3-氯-2-吡啶基)乙基]-2,4-二氯-3-吡啶羧醯胺，

N-[(5-溴-3-氯-2-吡啶基)甲基]-2,4-二氯-6-甲基-3-吡啶羧醯胺，

N-[1-(3-氯-5-碘-2-吡啶基)乙基]-2,4-二氯-6-甲基-3-吡啶羧醯胺，

N-[(3-氯-5-碘-2-吡啶基)甲基]-2,4-二氯-3-吡啶羧醯胺，

N-[1-(3-氯-5-碘-2-吡啶基)乙基]-2,4-二氯-3-吡啶羧醯胺，

N-[(3-氯-5-碘-2-吡啶基)甲基]-2,4-二氯-6-甲基-3-吡啶羧醯胺，與

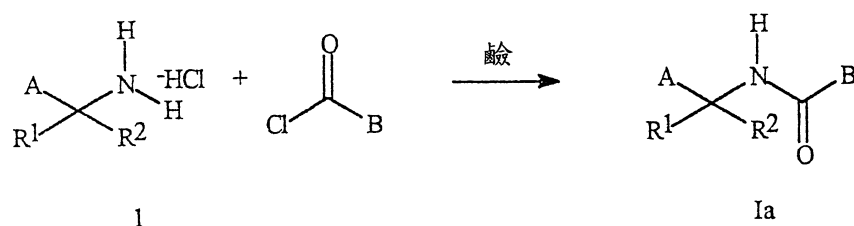
N-[1-(3-氯-5-碘-2-吡啶基)乙基]-2,4-二氯-6-甲基-3-吡啶羧醯胺。

本發明亦係有關控制由真菌性植物病原造成之植物疾病的方法，包括施予植物或其部份或植物種子或幼苗，有效量之本發明組合物(亦即，本文所述之組合物)。較佳使用方法係涉及上述較佳組合物者。

得如圖式1-5所述，採下述一或多種方法及其變體製備式I化合物。下述式1-4化合物的A、B、R¹至R⁶之定義係如上述者。式1a、1b與1c之化合物係式1之亞組。式1a、1b與1c之化合物係式I之亞組，而且式1a、1b與1c之取代物係如上述式I所定義。

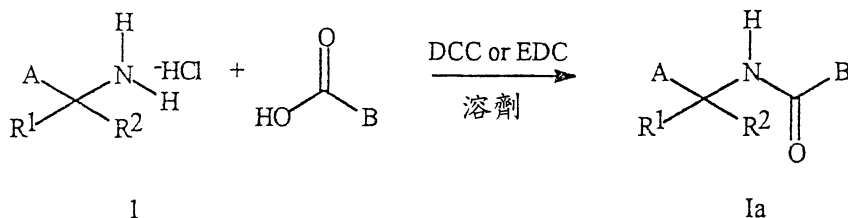
如圖式1所示，得於惰性溶劑與兩倍莫耳當量之鹼(例如三乙胺或碳酸鉀)的條件下，處理式1之胺鹽與適當之氯化醯製備式Ia之化合物。適當溶劑係選自包括諸如四氫呋喃、二甲氧基乙烷或乙醚之醚類，諸如甲苯或苯之涇類或諸如二氯甲烷或氯仿之鹵化碳化合物。

圖式1



如圖式2所示，得利用式1之胺鹽與適當之羧酸於諸如1,3-二環己基羰二亞醯胺(DCC)或1-[3-(二甲基胺基)丙基]-3-乙基羰二亞醯胺鹽酸鹽(EDC)之有機脫水劑條件下反應，另外合成式Ia化合物。適當溶劑係選自包括諸如四氫呋喃、二甲氧基乙烷或乙醚之醚類，諸如甲苯或苯之涇類或諸如二氯甲烷或氯仿之鹵化碳化合物。

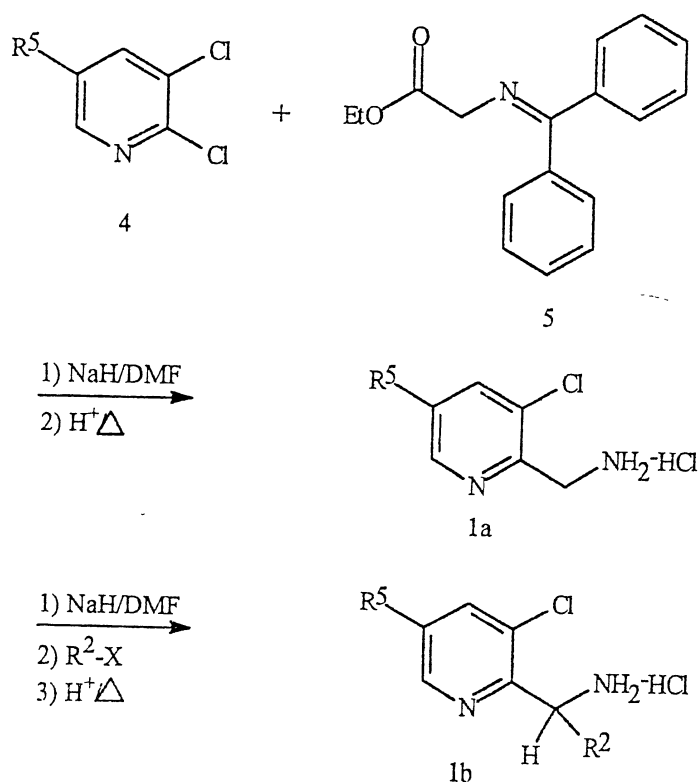
圖式2



如圖式3所示，得利用市售之亞胺酯5與式4之2,3-二氯吡啶，在溶於諸如N,N-二甲基甲醯胺之極性非質子化溶劑之諸如氫化鈉的強鹼條件下反應，隨之於類似WO 99/42447所

見之方法的酸性媒介中加熱製備其A為帶所述取代基之2-吡啶基而 R^1 與 R^2 為氫之式1a之胺鹽。得採類似方法製備式1b化合物，其中步驟1生成之中間體陰離子係加熱之前於酸媒介中經諸如碘化甲烷之 R^2 -X烷化劑處理者。在烷化劑 R^2 -X中，X為諸如鹵素(例如Br、I)、 $OS(O)_2CH_3$ (甲烷磺酸酯)、 $OS(O)_2CF_3$ 、 $OS(O)_2Ph$ -對- CH_3 (對-甲苯磺酸酯)及其類似物之適當離去基，甲烷磺酸酯表現良好。重要的是1a、1b與其中 R^5 為 CF_3 之4的化合物。

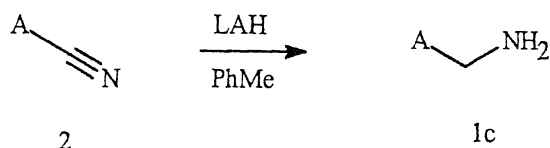
圖式3



如圖式4所示，得利用氫化鋰鋁(LAH)之甲苯溶液還原式2的腈類(其中A為經取代之2-吡啶環)之腈部分而合成帶胺甲基之式1c化合物(其中A為經取代之2-吡啶環)。

(14)

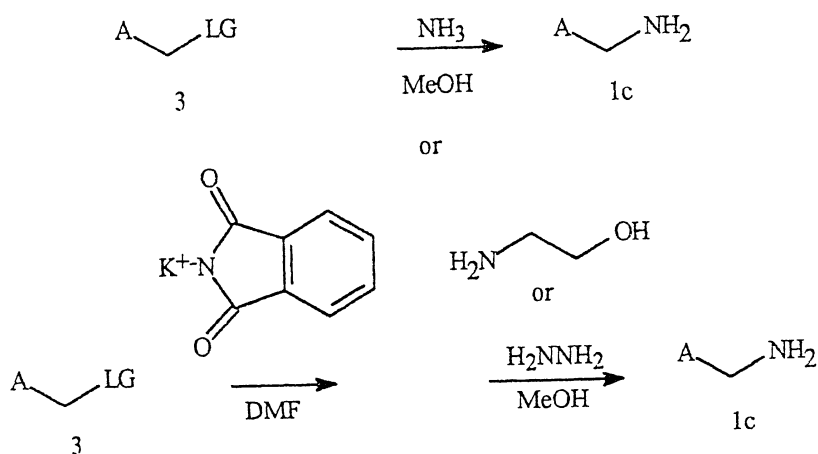
圖式 4



A為經取代之2-吡啶環

如圖式5所示，得利用式3化合物與溶於諸如甲醇之質子化溶劑的氨進行反應，提供式1c化合物(其中A為經取代之2-吡啶環)之方式另外合成式1c化合物。亦得利用式3化合物與鄰苯二甲醯亞胺之鉀鹽反應，隨之與胺基乙醇或連胺之酒精溶液反應提供所需之式1c的胺甲基中間產物。

圖式 5

LG為Cl、Br、-OSO₂Me、-OSO₂-對-Tol

已確認上述製備式I化合物之某些試劑與反應條件與中間產物之某些官能基可能無法相容。在這些例子中，合成中併用保護/去保護順序或官能基交互轉換，有助取得所需產物。使用與選取保護基對熟諳化學合成者是很清楚的(其例參照 Greene, T.W.; Wuts, P. G. M. Protective Groups in Organic

Synthesis, 第2版, Wiley: New York, 1991)。熟諳此藝者會明瞭, 如個別圖式, 在某些情形之引入特定試劑後可能需另外進行未詳述的例行性合成步驟以完成式I化合物之合成。熟諳此藝者亦會明瞭, 除了本文所示之製備式I化合物所指之特定順序外, 可能需進行上述圖式之組合步驟。

熟諳此藝者亦會明瞭, 本文所述之式I化合物及其中間體得訴諸不同親電基、親核基、自由基、有機金屬、氧化與還原反應以增加取代基或修飾現存取代基。

咸信, 無需多費心, 利用前述說明熟諳此藝者即能以最大限度製備包括本發明成分(a)之化合物。因而, 下列實例應僅理解為說明之用, 無論如何非做為本揭示之限制。除了色層分析溶劑混合物或另有說明之外, 百分比係指重量。除了另有說明之外, 色層分析溶劑混合物之分數或百分比係指體積。¹H-NMR光譜係以四甲基矽烷之高磁場方向ppm表示, s為單峰, d為雙峰, t為三峰, q為四峰, m為多峰, dd為雙重雙峰, dt為雙重三峰, br s為廣單峰。

實例 1

N-[1-(5-溴-3-氯-2-吡啶基)乙基]-2,4-二氯-3-吡啶羧醯胺之製備

步驟 A: 5-溴-3-氯-2(1H)-吡啶酮之製備

將6.2克氯化鉀之100毫升水溶液加至25克5-溴-2-吡啶酮之100毫升預熱至50-60°C之濃HCl溶液, 以在攪拌5分鐘後形成厚沈澱物, 然後加60毫升的以促進攪拌, 並將反應混合物於室溫隔夜攪拌。過濾反應混合物, 以水研製(2X), 並抽氣乾燥沉澱物以生成17.7克固體之標題化合物。

^1H NMR (CDCl_3) : δ 7.53 (d, 1H, J 為 2.6 Hz), 7.75 (d, 1H, J 為 2.5 Hz)。

步驟 B : 5-溴-2,3-二氯吡啶之製備

將 5-溴-3-氯-2(1H)-吡啶酮 (亦即步驟 A 之產物) (17.7 克), PCl_5 (10 克) 之 100 毫升 POCl_3 混合物滌氣之下迴流 4 小時。減壓濃縮反應混合物以去除大部分 POCl_3 , 小心倒入溫水中, 冷卻至室溫並經二氯甲烷萃取 (2X)。總和萃取物經硫酸鎂脫水並濃縮生成油, 將其進行管柱色析 (8:2/己烷 : 乙酸乙酯), 生成 4.2 克標題化合物之油。

^1H NMR (CDCl_3) : δ 7.94 (d, 1H, J 為 2.2 Hz), 8.37 (d, 1H, J 為 2.3 Hz)。

步驟 C : 5-溴-3-氯- α -甲基-2-吡啶甲胺鹽酸鹽之製備

於氮氣壓下, 將 5-溴-2,3-二氯吡啶 (亦即步驟 B 之產物) (4.1 克) 加至溶於 30 毫升無水 N,N-二甲基甲醯胺之氫化鈉之 0°C 懸浮液 (60% 油懸浮液) 中。分成數部分不產熱條件之下, 添加 N-(二苯基伸烷基)甘胺酸乙基酯 (4.6 克), 於室溫攪拌混合物 3 小時。於 $<30^\circ\text{C}$ 之下, 添加 3.4 毫升碘化甲烷, 並令反應混合物於室溫隔夜攪拌。以水稀釋反應混合物並經乙醚萃取 (2X)。總和萃取物經飽和鹽液洗過 (1X) 並濃縮成油, 然後於 50 毫升 12 當量濃度 HCl 中迴流 4 小時。將反應混合物濃縮生成油, 冷卻, 並以乙醚隔夜攪拌成泥漿。然後倒出乙醚並真空乾燥殘渣, 生成 1.3 克固體之標題化合物。

^1H NMR (CDCl_3) : 1.40 與 1.46 (dd, 3H, J 為 7.0 Hz), 4.7 (m, 1H), 8.48 (d, 1H, J 為 1.8), 8.6 (bs, 3H), 8.79 (d, 1H, J 為 1.9 Hz)。

步驟 D : N-[1-(5-溴-3-氯-2-吡啶)乙基]-2,4-二氯-3-吡啶羧醯

(17)

胺之製備

將 5-溴-3-氯- α -甲基-2-吡啶甲胺鹽酸鹽(亦即步驟 C 之產物)(0.80 克)、三乙胺(1.21 毫升)與氯化 2,4-二氯菸鹼鹽(0.62 克)之 25 毫升二氯甲烷溶液於室溫隔夜攪拌。濃縮反應混合物，以生成固體之標題化合物，即本發明之化合物。

^1H NMR (CDCl_3): δ 1.59 (d, 3H, J 為 6.6 Hz), 5.75(m, 1H), 7.3(bs, 1H), 7.34(d, 1H, J 為 5.2 Hz), 7.91(d, 1H, J 為 1.9 Hz) 8.33(d, 1H, J 為 5.4 Hz), 8.49(d, 1H, J 為 1.9 Hz)。

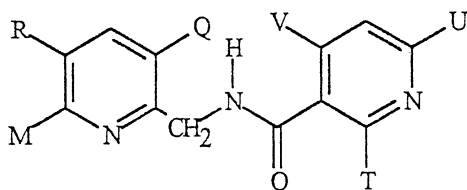
實例 22,4-二氯-N-[1-(3,5-二氯-2-吡啶基)乙基]-3-吡啶羧醯胺之製備

以類似實例 1 之方式製備實例 2，其係利用 2-溴-3,5-二氯吡啶為起始物，並將此原料付諸類似步驟 C(製備 3,5-二氯- α -甲基-2-吡啶基甲胺)與實例 1 之 D 的條件以生成固體之標題化合物。

^1H NMR (CDCl_3): δ 1.58(d, 3H, J=6.6 Hz), 5.7-5.8(m, 1H), 7.4(m, 2H), 7.77(m, 1H), 8.35(m, 1H), 8.40(m, 1H)。

適用於本發明組合物成分(a)之式 I 化合物的實例包括下表 1-5 之化合物。下列係下表中之縮寫：Et 為乙基、Ph 為苯基、CN 為氰基。取代基 M、Q 與 R 相當於位於指定位置之獨立的 R^5 取代基。取代基 T、U 與 V 相當於位於指定位置之獨立的 R^6 取代基。

表 1



T 與 V 皆為 Cl 而 U 為 H

Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	Cl	H	Br	Cl	H	Cl	Cl	Me
Cl	Br	H	Br	Br	H	Cl	Br	Me
Cl	OCF ₃	H	Br	OCF ₃	H	Cl	OCF ₃	Me
Cl	OCHF ₂	H	Br	OCHF ₂	H	Cl	OCHF ₂	Me
Cl	OCH ₂ CF ₃	H	Br	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₃	H	Br	OCF ₂ CF ₃	H	Cl	OCF ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₂ H	H	Br	OCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	OCHF ₂ CF ₃	H	Br	OCHF ₂ CF ₃	H	Cl	OCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₃	H	Br	SCF ₃	H	Cl	SCF ₃	Me
Cl	SCHF ₂	H	Br	SCHF ₂	H	Cl	SCHF ₂	Me
Cl	SCH ₂ CF ₃	H	Br	SCH ₂ CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₃	H	Br	SCF ₂ CF ₃	H	Cl	SCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SCHF ₂ CF ₃	H	Br	SCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₃	H	Br	SOCF ₃	H	Cl	SOCF ₃	Me
Cl	SOCHF ₂	H	Br	SOCHF ₂	H	Cl	SOCHF ₂	Me
Cl	SOCH ₂ CF ₃	H	Br	SOCH ₂ CF ₃	H	Cl	SOCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₃	H	Br	SOCF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SOCHF ₂ CF ₃	H	Br	SOCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂	H	Br	SO ₂ CHF ₂	H	Cl	SO ₂ CHF ₂	Me
Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me
Cl	CN	H	Br	CN	H	Cl	CN	Me
Br	SOCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₃	Me	Br	Cl	Me
Br	SO ₂ CF ₃	Me	Br	SOCHF ₂	Me	Br	Br	Me
Br	SO ₂ CHF ₂	Me	Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₃	Me
Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCHF ₂	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me	Br	SCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Br	CN	Me	Br	SCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCHF ₂ CF ₃	Me
Br	SCF ₃	Me	Br	SCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCHF ₂	Me
Cl	I	H	Br	I	H	I	I	H
Cl	I	Me	Br	I	Me	I	I	Me

(19)

發明說明續頁

T 與 V 皆為 Cl 而 U 為 CH₃

Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	Cl	H	Br	Cl	H	Cl	Cl	Me
Cl	Br	H	Br	Br	H	Cl	Br	Me
Cl	OCF ₃	H	Br	OCF ₃	H	Cl	OCF ₃	Me
Cl	OCHF ₂	H	Br	OCHF ₂	H	Cl	OCHF ₂	Me
Cl	OCH ₂ CF ₃	H	Br	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₃	H	Br	OCF ₂ CF ₃	H	Cl	OCF ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₂ H	H	Br	OCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	OCHF ₂ CF ₃	H	Br	OCHF ₂ CF ₃	H	Cl	OCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₃	H	Br	SCF ₃	H	Cl	SCF ₃	Me
Cl	SCHF ₂	H	Br	SCHF ₂	H	Cl	SCHF ₂	Me
Cl	SCH ₂ CF ₃	H	Br	SCH ₂ CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₃	H	Br	SCF ₂ CF ₃	H	Cl	SCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SCHF ₂ CF ₃	H	Br	SCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₃	H	Br	SOCF ₃	H	Cl	SOCF ₃	Me
Cl	SOCHF ₂	H	Br	SOCHF ₂	H	Cl	SOCHF ₂	Me
Cl	SOCH ₂ CF ₃	H	Br	SOCH ₂ CF ₃	H	Cl	SOCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₃	H	Br	SOCF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SOCHF ₂ CF ₃	H	Br	SOCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂	H	Br	SO ₂ CHF ₂	H	Cl	SO ₂ CHF ₂	Me
Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me
Cl	CN	H	Br	CN	H	Cl	CN	Me
Br	SOCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₃	Me	Br	Cl	Me
Br	SO ₂ CF ₃	Me	Br	SOCHF ₂	Me	Br	Br	Me
Br	SO ₂ CHF ₂	Me	Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₃	Me
Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCHF ₂	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me	Br	SCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Br	CN	Me	Br	SCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCHF ₂ CF ₃	Me
Br	SCF ₃	Me	Br	SCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCHF ₂	Me
Cl	I	H	Br	I	H	I	I	H
Cl	I	Me	Br	I	Me	I	I	Me

T 為 Cl 而 V 與 U 皆為 Me

Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	Cl	H	Br	Cl	H	Cl	Cl	Me
Cl	Br	H	Br	Br	H	Cl	Br	Me
Cl	OCF ₃	H	Br	OCF ₃	H	Cl	OCF ₃	Me
Cl	OCHF ₂	H	Br	OCHF ₂	H	Cl	OCHF ₂	Me
Cl	OCH ₂ CF ₃	H	Br	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₃	H	Br	OCF ₂ CF ₃	H	Cl	OCF ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₂ H	H	Br	OCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	OCHF ₂ CF ₃	H	Br	OCHF ₂ CF ₃	H	Cl	OCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₃	H	Br	SCF ₃	H	Cl	SCF ₃	Me
Cl	SCHF ₂	H	Br	SCHF ₂	H	Cl	SCHF ₂	Me
Cl	SCH ₂ CF ₃	H	Br	SCH ₂ CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₃	H	Br	SCF ₂ CF ₃	H	Cl	SCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SCHF ₂ CF ₃	H	Br	SCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₃	H	Br	SOCF ₃	H	Cl	SOCF ₃	Me
Cl	SOCHF ₂	H	Br	SOCHF ₂	H	Cl	SOCHF ₂	Me
Cl	SOCH ₂ CF ₃	H	Br	SOCH ₂ CF ₃	H	Cl	SOCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₃	H	Br	SOCF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SOCHF ₂ CF ₃	H	Br	SOCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂	H	Br	SO ₂ CHF ₂	H	Cl	SO ₂ CHF ₂	Me
Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me
Cl	CN	H	Br	CN	H	Cl	CN	Me
Br	SOCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₃	Me	Br	Cl	Me
Br	SO ₂ CF ₃	Me	Br	SOCHF ₂	Me	Br	Br	Me
Br	SO ₂ CHF ₂	Me	Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₃	Me
Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCHF ₂	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me	Br	SCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Br	CN	Me	Br	SCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCHF ₂ CF ₃	Me
Br	SCF ₃	Me	Br	SCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCHF ₂	Me
Cl	I	H	Br	I	H	I	I	H
Cl	I	Me	Br	I	Me	I	I	Me

(21)

發明說明續頁

T 為 Cl, V 為 I 而 U 為 H

Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	Cl	H	Br	Cl	H	Cl	Cl	Me
Cl	Br	H	Br	Br	H	Cl	Br	Me
Cl	OCF ₃	H	Br	OCF ₃	H	Cl	OCF ₃	Me
Cl	OCHF ₂	H	Br	OCHF ₂	H	Cl	OCHF ₂	Me
Cl	OCH ₂ CF ₃	H	Br	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₃	H	Br	OCF ₂ CF ₃	H	Cl	OCF ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₂ H	H	Br	OCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	OCHF ₂ CF ₃	H	Br	OCHF ₂ CF ₃	H	Cl	OCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₃	H	Br	SCF ₃	H	Cl	SCF ₃	Me
Cl	SCHF ₂	H	Br	SCHF ₂	H	Cl	SCHF ₂	Me
Cl	SCH ₂ CF ₃	H	Br	SCH ₂ CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₃	H	Br	SCF ₂ CF ₃	H	Cl	SCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SCHF ₂ CF ₃	H	Br	SCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₃	H	Br	SOCF ₃	H	Cl	SOCF ₃	Me
Cl	SOCHF ₂	H	Br	SOCHF ₂	H	Cl	SOCHF ₂	Me
Cl	SOCH ₂ CF ₃	H	Br	SOCH ₂ CF ₃	H	Cl	SOCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₃	H	Br	SOCF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SOCHF ₂ CF ₃	H	Br	SOCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂	H	Br	SO ₂ CHF ₂	H	Cl	SO ₂ CHF ₂	Me
Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me
Cl	CN	H	Br	CN	H	Cl	CN	Me
Br	SOCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₃	Me	Br	Cl	Me
Br	SO ₂ CF ₃	Me	Br	SOCHF ₂	Me	Br	Br	Me
Br	SO ₂ CHF ₂	Me	Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₃	Me
Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCHF ₂	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me	Br	SCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Br	CN	Me	Br	SCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCHF ₂ CF ₃	Me
Br	SCF ₃	Me	Br	SCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCHF ₂	Me
Cl	I	H	Br	I	H	I	I	H
Cl	I	Me	Br	I	Me	I	I	Me

(22)

發明說明續頁

T 為 Cl, V 為 I 而 U 為 Me

Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	Cl	H	Br	Cl	H	Cl	Cl	Me
Cl	Br	H	Br	Br	H	Cl	Br	Me
Cl	OCF ₃	H	Br	OCF ₃	H	Cl	OCF ₃	Me
Cl	OCHF ₂	H	Br	OCHF ₂	H	Cl	OCHF ₂	Me
Cl	OCH ₂ CF ₃	H	Br	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₃	H	Br	OCF ₂ CF ₃	H	Cl	OCF ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₂ H	H	Br	OCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	OCHF ₂ CF ₃	H	Br	OCHF ₂ CF ₃	H	Cl	OCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₃	H	Br	SCF ₃	H	Cl	SCF ₃	Me
Cl	SCHF ₂	H	Br	SCHF ₂	H	Cl	SCHF ₂	Me
Cl	SCH ₂ CF ₃	H	Br	SCH ₂ CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₃	H	Br	SCF ₂ CF ₃	H	Cl	SCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SCHF ₂ CF ₃	H	Br	SCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₃	H	Br	SOCF ₃	H	Cl	SOCF ₃	Me
Cl	SOCHF ₂	H	Br	SOCHF ₂	H	Cl	SOCHF ₂	Me
Cl	SOCH ₂ CF ₃	H	Br	SOCH ₂ CF ₃	H	Cl	SOCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₃	H	Br	SOCF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SOCHF ₂ CF ₃	H	Br	SOCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂	H	Br	SO ₂ CHF ₂	H	Cl	SO ₂ CHF ₂	Me
Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me
Cl	CN	H	Br	CN	H	Cl	CN	Me
Br	SOCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₃	Me	Br	Cl	Me
Br	SO ₂ CF ₃	Me	Br	SOCHF ₂	Me	Br	Br	Me
Br	SO ₂ CHF ₂	Me	Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₃	Me
Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCHF ₂	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me	Br	SCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Br	CN	Me	Br	SCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCHF ₂ CF ₃	Me
Br	SCF ₃	Me	Br	SCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCHF ₂	Me
Cl	I	H	Br	I	H	I	I	H
Cl	I	Me	Br	I	Me	I	I	Me

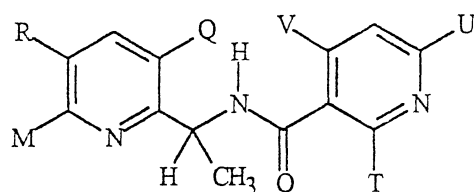
(23)

發明說明續頁

T 為 F, V 為 I 而 U 為 H								
Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	Cl	H	Br	Cl	H	Cl	Cl	Me
Cl	Br	H	Br	Br	H	Cl	Br	Me
Cl	OCF ₃	H	Br	OCF ₃	H	Cl	OCF ₃	Me
Cl	OCHF ₂	H	Br	OCHF ₂	H	Cl	OCHF ₂	Me
Cl	OCH ₂ CF ₃	H	Br	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₃	H	Br	OCF ₂ CF ₃	H	Cl	OCF ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₂ H	H	Br	OCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	OCHF ₂ CF ₃	H	Br	OCHF ₂ CF ₃	H	Cl	OCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₃	H	Br	SCF ₃	H	Cl	SCF ₃	Me
Cl	SCHF ₂	H	Br	SCHF ₂	H	Cl	SCHF ₂	Me
Cl	SCH ₂ CF ₃	H	Br	SCH ₂ CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₃	H	Br	SCF ₂ CF ₃	H	Cl	SCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SCHF ₂ CF ₃	H	Br	SCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₃	H	Br	SOCF ₃	H	Cl	SOCF ₃	Me
Cl	SOCHF ₂	H	Br	SOCHF ₂	H	Cl	SOCHF ₂	Me
Cl	SOCH ₂ CF ₃	H	Br	SOCH ₂ CF ₃	H	Cl	SOCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₃	H	Br	SOCF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SOCHF ₂ CF ₃	H	Br	SOCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂	H	Br	SO ₂ CHF ₂	H	Cl	SO ₂ CHF ₂	Me
Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me
Cl	CN	H	Br	CN	H	Cl	CN	Me
Br	SOCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₃	Me	Br	Cl	Me
Br	SO ₂ CF ₃	Me	Br	SOCHF ₂	Me	Br	Br	Me
Br	SO ₂ CHF ₂	Me	Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₃	Me
Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCHF ₂	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me	Br	SCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Br	CN	Me	Br	SCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCHF ₂ CF ₃	Me
Br	SCF ₃	Me	Br	SCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCHF ₂	Me
Cl	I	H	Br	I	H	I	I	H
Cl	I	Me	Br	I	Me	I	I	Me

T 為 I, V 為 Cl 而 U 為 H								
Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	Cl	H	Br	Cl	H	Cl	Cl	Me
Cl	Br	H	Br	Br	H	Cl	Br	Me
Cl	OCF ₃	H	Br	OCF ₃	H	Cl	OCF ₃	Me
Cl	OCHF ₂	H	Br	OCHF ₂	H	Cl	OCHF ₂	Me
Cl	OCH ₂ CF ₃	H	Br	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₃	H	Br	OCF ₂ CF ₃	H	Cl	OCF ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₂ H	H	Br	OCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	OCHF ₂ CF ₃	H	Br	OCHF ₂ CF ₃	H	Cl	OCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₃	H	Br	SCF ₃	H	Cl	SCF ₃	Me
Cl	SCHF ₂	H	Br	SCHF ₂	H	Cl	SCHF ₂	Me
Cl	SCH ₂ CF ₃	H	Br	SCH ₂ CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₃	H	Br	SCF ₂ CF ₃	H	Cl	SCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SCHF ₂ CF ₃	H	Br	SCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₃	H	Br	SOCF ₃	H	Cl	SOCF ₃	Me
Cl	SOCHF ₂	H	Br	SOCHF ₂	H	Cl	SOCHF ₂	Me
Cl	SOCH ₂ CF ₃	H	Br	SOCH ₂ CF ₃	H	Cl	SOCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₃	H	Br	SOCF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SOCHF ₂ CF ₃	H	Br	SOCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂	H	Br	SO ₂ CHF ₂	H	Cl	SO ₂ CHF ₂	Me
Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me
Cl	CN	H	Br	CN	H	Cl	CN	Me
Br	SOCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₃	Me	Br	Cl	Me
Br	SO ₂ CF ₃	Me	Br	SOCHF ₂	Me	Br	Br	Me
Br	SO ₂ CHF ₂	Me	Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₃	Me
Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCHF ₂	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me	Br	SCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Br	CN	Me	Br	SCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCHF ₂ CF ₃	Me
Br	SCF ₃	Me	Br	SCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCHF ₂	Me
Cl	I	H	Br	I	H	I	I	H
Cl	I	Me	Br	I	Me	I	I	Me

表 2



T 與 V 皆為 Cl 而 U 為 H

Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	Cl	H	Br	Cl	H	Cl	Cl	Me
Cl	Br	H	Br	Br	H	Cl	Br	Me
Cl	OCF ₃	H	Br	OCF ₃	H	Cl	OCF ₃	Me
Cl	OCHF ₂	H	Br	OCHF ₂	H	Cl	OCHF ₂	Me
Cl	OCH ₂ CF ₃	H	Br	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₃	H	Br	OCF ₂ CF ₃	H	Cl	OCF ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₂ H	H	Br	OCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	OCHF ₂ CF ₃	H	Br	OCHF ₂ CF ₃	H	Cl	OCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₃	H	Br	SCF ₃	H	Cl	SCF ₃	Me
Cl	SCHF ₂	H	Br	SCHF ₂	H	Cl	SCHF ₂	Me
Cl	SCH ₂ CF ₃	H	Br	SCH ₂ CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₃	H	Br	SCF ₂ CF ₃	H	Cl	SCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SCHF ₂ CF ₃	H	Br	SCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₃	H	Br	SOCF ₃	H	Cl	SOCF ₃	Me
Cl	SOCHF ₂	H	Br	SOCHF ₂	H	Cl	SOCHF ₂	Me
Cl	SOCH ₂ CF ₃	H	Br	SOCH ₂ CF ₃	H	Cl	SOCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₃	H	Br	SOCF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SOCHF ₂ CF ₃	H	Br	SOCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂	H	Br	SO ₂ CHF ₂	H	Cl	SO ₂ CHF ₂	Me
Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me
Cl	CN	H	Br	CN	H	Cl	CN	Me
Br	SOCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₃	Me	Br	Cl	Me
Br	SO ₂ CF ₃	Me	Br	SOCHF ₂	Me	Br	Br	Me
Br	SO ₂ CHF ₂	Me	Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₃	Me
Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCHF ₂	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me	Br	SCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Br	CN	Me	Br	SCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCHF ₂ CF ₃	Me
Br	SCF ₃	Me	Br	SCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCHF ₂	Me
Cl	I	H	Br	I	H	I	I	H
Cl	I	Me	Br	I	Me	I	I	Me

T 與 V 皆為 Cl 而 U 為 CH₃

Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	Cl	H	Br	Cl	H	Cl	Cl	Me
Cl	Br	H	Br	Br	H	Cl	Br	Me
Cl	OCF ₃	H	Br	OCF ₃	H	Cl	OCF ₃	Me
Cl	OCHF ₂	H	Br	OCHF ₂	H	Cl	OCHF ₂	Me
Cl	OCH ₂ CF ₃	H	Br	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₃	H	Br	OCF ₂ CF ₃	H	Cl	OCF ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₂ H	H	Br	OCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	OCHF ₂ CF ₃	H	Br	OCHF ₂ CF ₃	H	Cl	OCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₃	H	Br	SCF ₃	H	Cl	SCF ₃	Me
Cl	SCHF ₂	H	Br	SCHF ₂	H	Cl	SCHF ₂	Me
Cl	SCH ₂ CF ₃	H	Br	SCH ₂ CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₃	H	Br	SCF ₂ CF ₃	H	Cl	SCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SCHF ₂ CF ₃	H	Br	SCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₃	H	Br	SOCF ₃	H	Cl	SOCF ₃	Me
Cl	SOCHF ₂	H	Br	SOCHF ₂	H	Cl	SOCHF ₂	Me
Cl	SOCH ₂ CF ₃	H	Br	SOCH ₂ CF ₃	H	Cl	SOCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₃	H	Br	SOCF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SOCHF ₂ CF ₃	H	Br	SOCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂	H	Br	SO ₂ CHF ₂	H	Cl	SO ₂ CHF ₂	Me
Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me
Cl	CN	H	Br	CN	H	Cl	CN	Me
Br	SOCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₃	Me	Br	Cl	Me
Br	SO ₂ CF ₃	Me	Br	SOCHF ₂	Me	Br	Br	Me
Br	SO ₂ CHF ₂	Me	Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₃	Me
Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCHF ₂	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me	Br	SCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Br	CN	Me	Br	SCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCHF ₂ CF ₃	Me
Br	SCF ₃	Me	Br	SCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCHF ₂	Me
Cl	I	H	Br	I	H	I	I	H
Cl	I	Me	Br	I	Me	I	I	Me

T 為 Cl 而 V 與 U 皆為 Me :

Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	Cl	H	Br	Cl	H	Cl	Cl	Me
Cl	Br	H	Br	Br	H	Cl	Br	Me
Cl	OCF ₃	H	Br	OCF ₃	H	Cl	OCF ₃	Me

(27)

發明說明續頁

T 為 Cl 而 V 與 U 皆為 Me

Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	OCHF ₂	H	Br	OCHF ₂	H	Cl	OCHF ₂	Me
Cl	OCH ₂ CF ₃	H	Br	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₃	H	Br	OCF ₂ CF ₃	H	Cl	OCF ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₂ H	H	Br	OCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	OCHF ₂ CF ₃	H	Br	OCHF ₂ CF ₃	H	Cl	OCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₃	H	Br	SCF ₃	H	Cl	SCF ₃	Me
Cl	SCHF ₂	H	Br	SCHF ₂	H	Cl	SCHF ₂	Me
Cl	SCH ₂ CF ₃	H	Br	SCH ₂ CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₃	H	Br	SCF ₂ CF ₃	H	Cl	SCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SCHF ₂ CF ₃	H	Br	SCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₃	H	Br	SOCF ₃	H	Cl	SOCF ₃	Me
Cl	SOCHF ₂	H	Br	SOCHF ₂	H	Cl	SOCHF ₂	Me
Cl	SOCH ₂ CF ₃	H	Br	SOCH ₂ CF ₃	H	Cl	SOCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₃	H	Br	SOCF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SOCHF ₂ CF ₃	H	Br	SOCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂	H	Br	SO ₂ CHF ₂	H	Cl	SO ₂ CHF ₂	Me
Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me
Cl	CN	H	Br	CN	H	Cl	CN	Me
Br	SOCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₃	Me	Br	Cl	Me
Br	SO ₂ CF ₃	Me	Br	SOCHF ₂	Me	Br	Br	Me
Br	SO ₂ CHF ₂	Me	Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₃	Me
Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCHF ₂	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me	Br	SCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Br	CN	Me	Br	SCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCHF ₂ CF ₃	Me
Br	SCF ₃	Me	Br	SCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCHF ₂	Me
Cl	I	H	Br	I	H	I	I	H
Cl	I	Me	Br	I	Me	I	I	Me

T 為 Cl, V 為 I 而 U 為 H

Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	Cl	H	Br	Cl	H	Cl	Cl	Me
Cl	Br	H	Br	Br	H	Cl	Br	Me
Cl	OCF ₃	H	Br	OCF ₃	H	Cl	OCF ₃	Me
Cl	OCHF ₂	H	Br	OCHF ₂	H	Cl	OCHF ₂	Me
Cl	OCH ₂ CF ₃	H	Br	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₃	H	Br	OCF ₂ CF ₃	H	Cl	OCF ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₂ H	H	Br	OCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	OCHF ₂ CF ₃	H	Br	OCHF ₂ CF ₃	H	Cl	OCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₃	H	Br	SCF ₃	H	Cl	SCF ₃	Me

T 為 Cl, V 為 I 而 U 為 H

Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	SCHF ₂	H	Br	SCHF ₂	H	Cl	SCHF ₂	Me
Cl	SCH ₂ CF ₃	H	Br	SCH ₂ CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₃	H	Br	SCF ₂ CF ₃	H	Cl	SCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SCHF ₂ CF ₃	H	Br	SCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₃	H	Br	SOCF ₃	H	Cl	SOCF ₃	Me
Cl	SOCHF ₂	H	Br	SOCHF ₂	H	Cl	SOCHF ₂	Me
Cl	SOCH ₂ CF ₃	H	Br	SOCH ₂ CF ₃	H	Cl	SOCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₃	H	Br	SOCF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SOCHF ₂ CF ₃	H	Br	SOCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂	H	Br	SO ₂ CHF ₂	H	Cl	SO ₂ CHF ₂	Me
Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me
Cl	CN	H	Br	CN	H	Cl	CN	Me
Br	SOCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₃	Me	Br	Cl	Me
Br	SO ₂ CF ₃	Me	Br	SOCHF ₂	Me	Br	Br	Me
Br	SO ₂ CHF ₂	Me	Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₃	Me
Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCHF ₂	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me	Br	SCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Br	CN	Me	Br	SCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCHF ₂ CF ₃	Me
Br	SCF ₃	Me	Br	SCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCHF ₂	Me
Cl	I	H	Br	I	H	I	I	H
Cl	I	Me	Br	I	Me	I	I	Me

T 為 Cl, V 為 I 而 U 為 Me

Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	Cl	H	Br	Cl	H	Cl	Cl	Me
Cl	Br	H	Br	Br	H	Cl	Br	Me
Cl	OCF ₃	H	Br	OCF ₃	H	Cl	OCF ₃	Me
Cl	OCHF ₂	H	Br	OCHF ₂	H	Cl	OCHF ₂	Me
Cl	OCH ₂ CF ₃	H	Br	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₃	H	Br	OCF ₂ CF ₃	H	Cl	OCF ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₂ H	H	Br	OCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	OCHF ₂ CF ₃	H	Br	OCHF ₂ CF ₃	H	Cl	OCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₃	H	Br	SCF ₃	H	Cl	SCF ₃	Me
Cl	SCHF ₂	H	Br	SCHF ₂	H	Cl	SCHF ₂	Me
Cl	SCH ₂ CF ₃	H	Br	SCH ₂ CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₃	H	Br	SCF ₂ CF ₃	H	Cl	SCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SCHF ₂ CF ₃	H	Br	SCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SCHF ₂ CF ₃	Me

(29)

發明說明續頁

T 為 Cl, V 為 I 而 U 為 Me

Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	SOCF ₃	H	Br	SOCF ₃	H	Cl	SOCF ₃	Me
Cl	SOCHF ₂	H	Br	SOCHF ₂	H	Cl	SOCHF ₂	Me
Cl	SOCH ₂ CF ₃	H	Br	SOCH ₂ CF ₃	H	Cl	SOCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₃	H	Br	SOCF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SOCHF ₂ CF ₃	H	Br	SOCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂	H	Br	SO ₂ CHF ₂	H	Cl	SO ₂ CHF ₂	Me
Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me
Cl	CN	H	Br	CN	H	Cl	CN	Me
Br	SOCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₃	Me	Br	Cl	Me
Br	SO ₂ CF ₃	Me	Br	SOCHF ₂	Me	Br	Br	Me
Br	SO ₂ CHF ₂	Me	Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₃	Me
Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCHF ₂	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me	Br	SCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Br	CN	Me	Br	SCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCHF ₂ CF ₃	Me
Br	SCF ₃	Me	Br	SCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SCHF ₂	Me
Cl	I	H	Br	I	H	I	I	H
Cl	I	Me	Br	I	Me	I	I	Me

T 為 F, V 為 I 而 U 為 H

Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	Cl	H	Br	Cl	H	Cl	Cl	Me
Cl	Br	H	Br	Br	H	Cl	Br	Me
Cl	OCF ₃	H	Br	OCF ₃	H	Cl	OCF ₃	Me
Cl	OCHF ₂	H	Br	OCHF ₂	H	Cl	OCHF ₂	Me
Cl	OCH ₂ CF ₃	H	Br	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₃	H	Br	OCF ₂ CF ₃	H	Cl	OCF ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₂ H	H	Br	OCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	OCHF ₂ CF ₃	H	Br	OCHF ₂ CF ₃	H	Cl	OCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₃	H	Br	SCF ₃	H	Cl	SCF ₃	Me
Cl	SCHF ₂	H	Br	SCHF ₂	H	Cl	SCHF ₂	Me
Cl	SCH ₂ CF ₃	H	Br	SCH ₂ CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₃	H	Br	SCF ₂ CF ₃	H	Cl	SCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SCHF ₂ CF ₃	H	Br	SCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₃	H	Br	SOCF ₃	H	Cl	SOCF ₃	Me
Cl	SOCHF ₂	H	Br	SOCHF ₂	H	Cl	SOCHF ₂	Me
Cl	SOCH ₂ CF ₃	H	Br	SOCH ₂ CF ₃	H	Cl	SOCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₃	H	Br	SOCF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SOCHF ₂ CF ₃	H	Br	SOCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCHF ₂ CF ₃	Me

T 為 F，V 為 I 而 U 為 H

Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	SO ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂	H	Br	SO ₂ CHF ₂	H	Cl	SO ₂ CHF ₂	Me
Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me
Cl	CN	H	Br	CN	H	Cl	CN	Me
Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	Cl	Me
Br	SO ₂ CF ₃	Me	Br	SOCH ₂ CF ₂	Me	Br	Br	Me
Br	SO ₂ CHF ₂	Me	Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₃	Me
Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	Br	SOCH ₂ CF ₂	Me	Br	OCHF ₂	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me	Br	SOCH ₂ CF ₂	Me	Br	OCF ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Br	CN	Me	Br	SOCH ₂ CF ₂	Me	Br	OCHF ₂ CF ₃	Me
Br	SCF ₃	Me	Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	SCHF ₂	Me
Cl	I	H	Br	I	H	I	I	H
Cl	I	Me	Br	I	Me	I	I	Me

T 為 I，V 為 Cl 而 U 為 H

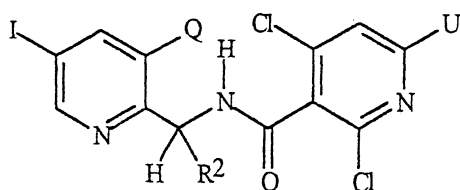
Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	Cl	H	Br	Cl	H	Cl	Cl	Me
Cl	Br	H	Br	Br	H	Cl	Br	Me
Cl	OCF ₃	H	Br	OCF ₃	H	Cl	OCF ₃	Me
Cl	OCHF ₂	H	Br	OCHF ₂	H	Cl	OCHF ₂	Me
Cl	OCH ₂ CF ₃	H	Br	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₃	H	Br	OCF ₂ CF ₃	H	Cl	OCF ₂ CF ₃	Me
Cl	OCF ₂ CF ₂ H	H	Br	OCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	OCHF ₂ CF ₃	H	Br	OCHF ₂ CF ₃	H	Cl	OCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₃	H	Br	SCF ₃	H	Cl	SCF ₃	Me
Cl	SCHF ₂	H	Br	SCHF ₂	H	Cl	SCHF ₂	Me
Cl	SCH ₂ CF ₃	H	Br	SCH ₂ CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₃	H	Br	SCF ₂ CF ₃	H	Cl	SCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SCHF ₂ CF ₃	H	Br	SCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₃	H	Br	SOCF ₃	H	Cl	SOCF ₃	Me
Cl	SOCHF ₂	H	Br	SOCHF ₂	H	Cl	SOCHF ₂	Me
Cl	SOCH ₂ CF ₃	H	Br	SOCH ₂ CF ₃	H	Cl	SOCH ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₃	H	Br	SOCF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCF ₂ CF ₃	Me
Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SOCF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SOCHF ₂ CF ₃	H	Br	SOCHF ₂ CF ₃	H	Cl	SOCHF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂	H	Br	SO ₂ CHF ₂	H	Cl	SO ₂ CHF ₂	Me
Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me
Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	H	Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me
Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Br	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	H	Cl	SO ₂ CHF ₂ CF ₃	Me

(31)

發明說明續頁

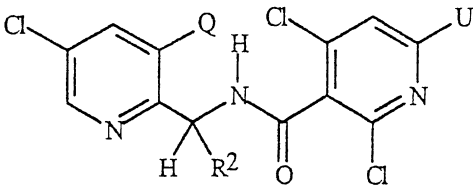
T 為 I, V 為 Cl 而 U 為 H								
Q	R	M	Q	R	M	Q	R	M
Cl	CN	H	Br	CN	H	Cl	CN	Me
Br	SOCHF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₃	Me	Br	Cl	Me
Br	SO ₂ CF ₃	Me	Br	SOCHF ₂	Me	Br	Br	Me
Br	SO ₂ CHF ₂	Me	Br	SOCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₃	Me
Br	SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCHF ₂	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₃	Me	Br	SOCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H	Me	Br	SCH ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₃	Me
Br	SO ₂ CHFCF ₃	Me	Br	SCF ₂ CF ₃	Me	Br	OCF ₂ CF ₂ H	Me
Br	CN	Me	Br	SCF ₂ CF ₂ H	Me	Br	OCHF ₂ CF ₃	Me
Br	SCF ₃	Me	Br	SCHFCF ₃	Me	Br	SCHF ₂	Me
Cl	I	H	Br	I	H	I	I	H
Cl	I	Me	Br	I	Me	I	I	Me

表 3



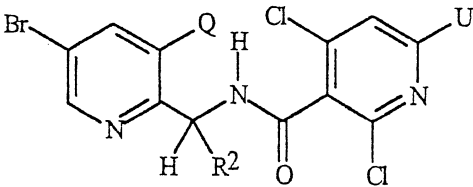
Q	R ²	U	Q	R ²	U	Q	R ²	U
I	H	H	I	Me	H	I	H	Me
OCHF ₂	H	H	OCHF ₂	Me	H	OCHF ₂	H	Me
OCH ₂ F	H	H	OCH ₂ F	Me	H	OCH ₂ F	H	Me
OCF ₂ Cl	H	H	OCF ₂ Cl	Me	H	OCF ₂ Cl	H	Me
OCH ₂ CF ₃	H	H	OCH ₂ CF ₃	Me	H	OCH ₂ CF ₃	H	Me
Et	H	H	Et	Me	H	Et	H	Me
CN	H	H	CN	Me	H	CN	H	Me
SCF ₃	H	H	SCF ₃	Me	H	SCF ₃	H	Me
SCHF ₂	H	H	SCHF ₂	Me	H	SCHF ₂	H	Me
SCH ₂ F	H	H	SCH ₂ F	Me	H	SCH ₂ F	H	Me
Ph	H	H	Ph	Me	H	Ph	H	Me
SiMe ₃	H	H	SiMe ₃	Me	H	SiMe ₃	H	Me
I	Me	Me	CN	Me	Me	SCHF ₂	Me	Me
OCHF ₂	Me	Me	SCF ₃	Me	Me	SCH ₂ F	Me	Me
OCH ₂ F	Me	Me	OCH ₂ CF ₃	Me	Me	Ph	Me	Me
OCF ₂ Cl	Me	Me	Et	Me	Me	SiMe ₃	Me	Me

表 4



Q	R ²	U	Q	R ²	U	Q	R ²	U
I	H	H	I	Me	H	I	H	Me
OCHF ₂	H	H	OCHF ₂	Me	H	OCHF ₂	H	Me
OCH ₂ F	H	H	OCH ₂ F	Me	H	OCH ₂ F	H	Me
OCF ₂ Cl	H	H	OCF ₂ Cl	Me	H	OCF ₂ Cl	H	Me
OCH ₂ CF ₃	H	H	OCH ₂ CF ₃	Me	H	OCH ₂ CF ₃	H	Me
Et	H	H	Et	Me	H	Et	H	Me
CN	H	H	CN	Me	H	CN	H	Me
SCF ₃	H	H	SCF ₃	Me	H	SCF ₃	H	Me
SCHF ₂	H	H	SCHF ₂	Me	H	SCHF ₂	H	Me
SCH ₂ F	H	H	SCH ₂ F	Me	H	SCH ₂ F	H	Me
Ph	H	H	Ph	Me	H	Ph	H	Me
SiMe ₃	H	H	SiMe ₃	Me	H	SiMe ₃	H	Me
I	Me	Me	CN	Me	Me	SCHF ₂	Me	Me
OCHF ₂	Me	Me	SCF ₃	Me	Me	SCH ₂ F	Me	Me
OCH ₂ F	Me	Me	OCH ₂ CF ₃	Me	Me	Ph	Me	Me
OCF ₂ Cl	Me	Me	Et	Me	Me	SiMe ₃	Me	Me

表 5



Q	R ²	U	Q	R ²	U	Q	R ²	U
I	H	H	I	Me	H	I	H	Me
OCHF ₂	H	H	OCHF ₂	Me	H	OCHF ₂	H	Me
OCH ₂ F	H	H	OCH ₂ F	Me	H	OCH ₂ F	H	Me
OCF ₂ Cl	H	H	OCF ₂ Cl	Me	H	OCF ₂ Cl	H	Me
OCH ₂ CF ₃	H	H	OCH ₂ CF ₃	Me	H	OCH ₂ CF ₃	H	Me
Et	H	H	Et	Me	H	Et	H	Me
CN	H	H	CN	Me	H	CN	H	Me
SCF ₃	H	H	SCF ₃	Me	H	SCF ₃	H	Me
SCHF ₂	H	H	SCHF ₂	Me	H	SCHF ₂	H	Me
SCH ₂ F	H	H	SCH ₂ F	Me	H	SCH ₂ F	H	Me
Ph	H	H	Ph	Me	H	Ph	H	Me
SiMe ₃	H	H	SiMe ₃	Me	H	SiMe ₃	H	Me

Q	R ²	U	Q	R ²	U	Q	R ²	U
I	Me	Me	CN	Me	Me	SCHF ₂	Me	Me
OCHF ₂	Me	Me	SCF ₃	Me	Me	SCH ₂ F	Me	Me
OCH ₂ F	Me	Me	OCH ₂ CF ₃	Me	Me	Ph	Me	Me
OCF ₂ Cl	Me	Me	Et	Me	Me	SiMe ₃	Me	Me

本發明組合物之成分(b)的殺真菌劑係選自包括

(b1)伸烷基雙(二硫代胺基甲酸鹽)殺真菌劑，

(b2)作用於真菌粒線體呼吸電子傳遞位置之bc₁複合體的化合物，

(b3)克絕，

(b4)作用於固醇生化合成代謝路徑之去甲基酶的化合物，

(b5)作用於固醇生化合成代謝路徑之嗎福啉與哌啶化合物，

(b6)苯醯胺殺真菌劑，

(b7)嘧啶酮殺真菌劑，

(b8)鄰苯二甲醯亞胺與

(b9)福賽得。

成分(b)比成分(a)之重量比典型地為由100：1至1：100，以由30：1至1：30較佳，又以由10：1至1：10更加。重要的是成分(b)比成分(a)之重量比為由10：1至1：1者。包括其中成分(b)比成分(a)之重量比為由9：1至4.5：1之組合物。

bc₁複合體殺真菌劑(成分(b2))

目前已知諸如 azoxystrobin(亞拖敏)、克收欣(kresoxim-methyl)、美拖敏(metominostrobin)/非諾敏(fenominostrobin)(SSF-

(34)

126)、必哥敏 (picoxystrobin)、百克敏 (pyraclostrobin) 與三氟敏 (trifloxystrobin) 之史拖比 (strobilurin) 殺真菌劑具有抑制粒線體呼吸鏈 bc_1 複合體之殺真菌作用模式 (Angew. Chem. Int. Ed., 1999, 38, 1328-1349)。Biochemical Society Transactions 1993, 22, 68S 說明甲基 (E)-2-[[6-(2-氰苯氧基)-4-嘧啶基]氧基]- α -(甲氧基亞胺基) 苯乙酸酯 (亦名為亞拖敏) 係 bc_1 複合體抑制劑。Biochemical Society Transactions 1993, 22, 64S 說明甲基 (E)- α -(甲氧基亞胺基)-2-[(2-甲基苯氧基) 甲基] 苯乙酸酯 (亦名為克收欣) 係 bc_1 複合體抑制劑。Biochemical and Cell Biology 1995, 85(3), 306-311 說明 (E)-2-[(2,5-二甲基苯氧基) 甲基]- α -(甲氧基亞胺基)-N-甲基 苯乙醯胺係 bc_1 複合體抑制劑。其他抑制粒線體呼吸鏈之 bc_1 複合體的化合物包括凡殺 (famoxadone) 與芬那蜜 (fenamidone)。

在生化文獻中有時係以其他名字指稱 bc_1 複合體，包括電子傳遞鏈之錯合物 III 與泛氫醌：細胞色素 c 氧化還原酶。其經獨特指定為 Enzyme Commission 號碼 EC1.10.2.2。 bc_1 複合體之說明請參照 J. Biol. Chem. 1989, 264, 14543-38；Methods Enzymol. 1986, 126, 253-71；及其中所引之文獻。

固醇生化合成抑制劑殺真菌劑 (成分 (b4) 或 (b5))

固醇生化合成抑制劑之類包括 DMI 與非 -DMI 化合物，其係利用抑制固醇生化合成路徑之酶以控制真菌。DMI 殺真菌劑對真菌之固醇生化合成路徑有共同之作用位置，亦即抑制羊毛甾醇位置 14 或 24-亞甲基二氫羊毛甾醇，這些皆為真菌之固醇前驅物。作用於這些位置之化合物通常名為去甲基酶抑制劑，DMI 殺菌劑或 DMIs。在生化文獻中有時係

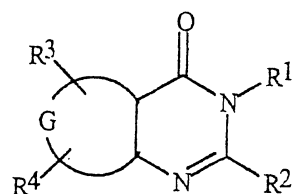
以其他名字指稱去甲基酶，包括細胞色素 p-450 (14DM)。去甲基酶之說明請參照 J. Biol. Chem. 1992, 267, 13175-79 及其中所引之文獻。DMI 殺真菌劑分成幾類：唑 (azole)(包括三唑與咪唑)、嘧啶、哌咻與吡啶。三唑類包括溴克座 (bromuconazole)、環克座 (cyproconazole)、待克利 (difenoconazole)、達克利 (diniconazole)、依普座 (epoxiconazole)、芬克座 (fenbuconazole)、福祿座 (fluquinconazole)、護矽得 (flusilazole)、護汰芬 (flutriafol)、菲克利 (hexaconazole)、易克座 (ipconazole)、麥克座 (metconazole)、平克座 (penconazole)、普克利 (propiconazole)、得克利 (tebuconazole)、四克利 (tetraconazole)、三泰芬 (triadimefon)、三泰諾 (triadimenol)、崔克座 (triticonazole) 與單克素 (uniconazole)。咪唑類包括陰道錠 (clotrimazole)、益可樂 (econazole)、依滅列 (imazalil)、艾可座 (isoconazole)、米可座 (miconazole) 與撲克拉 (prochloraz)。嘧啶類包括芬瑞莫 (fenarimol)、尼瑞莫 (nuarimol) 與崔瑞莫 (triarimol)。哌咻類包括賽福寧 (triforine)。吡啶類包括得滅多 (buthiobate) 與比芬諾 (pyrifenox)。生化調查顯示所有上述之殺真菌劑皆為 K. H. Kuck 等人於 Modern Selective Fungicides-Properties, Applications and Mechanisms of Action, Lyr, H., 編者；Gustav Fischer Verlag: New York, 1995, 205-258 所述之 DMI 殺真菌劑。

所以將 DMI 殺真菌劑歸為一類係為了將其與其他諸如嗎福啉與哌啶之固醇類生化合成抑制劑有所區分。嗎福啉與哌啶亦為固醇類生化合成抑制劑，然而實驗顯示其抑制固醇類生化合成之較後階段步驟。嗎福啉類包括阿迪莫 (aldimorph)、多迪莫 (dodemorph)、芬普莫 (fenpropimorph)、三得

芬 (tridemorph) 與 崔莫米 (trimorphamide)。哌啶類包括 芬普定 (fenpropidin)。生化調查顯示所有上述之嗎福啉與哌啶殺真菌劑皆為 K. H. Kuck 等人於 Modern Selective Fungicides-Properties, Applications and Mechanisms of Action, Lyr, H., 編者；Gustav Fischer Verlag: New York, 1995, 185-204 所述之固醇類生化合成抑制劑之殺真菌劑。

嘧啶酮殺真菌劑 (成分 (b7))

嘧啶酮殺真菌劑包括式 II 化合物



II

其中

G 為融合苯基、噻吩或吡啶環，

R¹ 為 C₁-C₆ 烷基，

R² 為 C₁-C₆ 烷基或 C₁-C₆ 烷氧基，

R³ 為鹵素，而

R⁴ 為氫或鹵素。

嘧啶酮殺真菌劑在國際專利申請 WO 94/26722、美國專利號碼 6,066,638、美國專利號碼 6,245,770、美國專利號碼 6,262,058 與美國專利號碼 6,277,858 有所說明。

重要的是選自下列之嘧啶酮殺真菌劑：

6-溴-3-丙基-2-丙基氧-4(3H)-喹唑酮，

6,8-二碘-3-丙基-2-丙基氧-4(3H)-喹唑酮，

(37)

6-碘-3-丙基-2-丙基氧-4(3H)-噻唑酮，
 6-氯-2-丙氧基-3-丙基硫烯[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮，
 6-溴-2-丙氧基-3-丙基硫烯[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮，
 7-溴-2-丙氧基-3-丙基硫烯[3,2-d]嘧啶-4(3H)-酮，
 6-溴-2-丙氧基-3-丙基吡啶并[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮，
 6,7-二溴-2-丙氧基-3-丙基硫烯[3,2-d]嘧啶-4(3H)-酮，與
 3-(環丙甲基)-6-碘-2-(丙基硫基)吡啶并[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮。

表 7

成分(b)之實例

(b1)諸如伸烷基雙(二硫代胺基甲酸鹽)殺真菌劑

(b3)克絕，

(b6)諸如苯醯胺殺真菌劑，

(b8)諸如鄰苯二甲醯亞胺

(b9)福賽得

得為本發明組合物加上式I化合物或額外成分加上成分(a)與成分(b)包括之其他殺真菌劑包括西本座(acibenzolar)、本達樂(benlaxyl)、免賴得(benomyl)、保米黴素(blasticidin-S)、波爾多(Bordeaux)混合物(三鹼基硫酸酮)、加普胺(carpropamid)、四氯丹(captafol)、蓋普丹(captan)、貝芬替(carbendazim)、克羅乃(chloroneb)、四氯異苯(chlorothalonil)、鹼性氯氧化銅(copper oxychloride)、諸如硫酸酮與氫氧化酮之酮鹽、賽座滅(cyazofamid)、克絕、賽普洛(cyprodinil)、(S)-3,5-二氯-N-(3-氯-1-乙基-1-甲基-2-氧丙基)-4-甲基苄醯胺(RH 7281)

、迪克賽 (diclocymet)(S-2900)、達滅淨 (diclomezine)、大克爛 (dicloran)、達滅芬 (dimethomorph)、達克利-M、多迪莫、多寧 (dodine)、護粒松 (edifenphos)、芬卡米 (fencaramid)(SZX0722)、芬比尼 (fenpiclonil)、三苯醋錫 (fentin acetate)、三苯羥錫 (fentin hydroxide)、扶吉胺 (fluazinam)、護汰寧 (fludioxonil)、弗米活 (flumetover)(RPA 403397)、福多寧 (flutolanil)、氟爾培 (folpet)、福賽得、福拉色 (furalaxyl)、福拉比 (furametapyr)(S-82658)、丙基喜樂松 (iprobenfos)、依普東 (iprodione)、亞賜圃 (isoprothiolane)、依普發 (iprovalicarb)、嘉賜黴素 (kasugamycin)、鋅錳乃浦 (mancozeb)、錳乃浦 (maneb)、麥弗山 (mefenoxam)、滅普寧 (mepronil)、滅達樂 (metalaxyl)、免得爛 (metiram-zinc)、邁克尼 (myclobutanil)、鐵甲砷酸胺 (neo-asozin)、歐殺斯 (oxadixyl)、賓克隆 (pencycuron)、撲克拉、撲滅寧 (procymidone)、普拔克 (propamocarb)、甲基鋅乃浦 (propineb)、比芬諾、吡美泥 (pyrimethanil)、百快隆 (pyroquilon)、快諾芬 (quinoxifen)、比洛山 (spiroxamine)、可濕性硫磺、賽氟滅 (thifluzamide)、甲基多保淨 (thiophanate-methyl)、得恩地 (thiram)、三泰芬、三賽唑 (tricyclazole)、微利黴素 (validamycin)、免克寧 (vinclozolin)、辛乃浦 (zineb) 與座沙米 (zoxamid)。

上述市售化合物之說明得參照 The Pesticide Manual，第 12 版，C.D.S. Tomlin，編者；British Crop Protection Council, 2000。

重要的是對抗藥性管理特別有利之具不同生化作用模式之殺真菌劑的式 I 之組合(例如粒線體呼吸抑制、利用干擾核糖體 RNA 合成之蛋白質合成抑制或 β 微管蛋白合成抑

制)。實例包括式I化合物(例如化合物1)與諸如亞拖敏、克收欣、百克敏與三氟敏之史拖比，貝芬替，諸如凡殺與芬那蜜之粒線體呼吸抑制劑，免賴得、克絕、達滅芬、氟爾培、福賽得、滅達樂、鋅錳乃浦與錳乃浦之組合。這些組合物對抗藥性管理特別有利，尤其是當組合之殺真菌劑可控制相同或不同疾病時。

重要的是具控制葡萄疾病(例如葡萄露病菌(*Plasmopara viticola*)、貴腐黴菌(*Botrytis cinerea*)與葡萄白粉病菌(*Uncinula necatur*))之殺真菌劑與式I之組合，包括諸如鋅錳乃浦、錳乃浦、甲基鋅乃浦與辛乃浦之伸烷基雙(二硫代胺基甲酸鹽)，諸如氟爾培之鄰苯二甲醯亞胺，諸如硫酸酮與氫氧化酮之銅鹽，諸如亞拖敏、百克敏與三氟敏之史拖比，諸如凡殺與芬那蜜之粒線體呼吸抑制劑，諸如滅達樂之苯醯胺，諸如福賽得之膦酸酯，達滅芬，諸如6-碘-3-丙基-2-丙基氧-4(3H)-喹唑酮與6-氯-2-丙氧基-3-丙基硫烯[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮之嘧啶酮殺真菌劑，與諸如克絕之其他殺真菌劑。

重要的是具控制馬鈴薯疾病(例如蕃茄晚疫菌(*Phytophthora infestans*)、早疫菌(*Alternaria solani*)與立枯絲核菌(*Rhizoctonia solani*))之殺真菌劑與式I之組合，包括諸如鋅錳乃浦、錳乃浦、甲基鋅乃浦與辛乃浦之伸烷基雙(二硫代胺基甲酸鹽)，諸如硫酸酮與氫氧化酮之銅鹽，諸如百克敏與三氟敏之史拖比，諸如凡殺與芬那蜜之粒線體呼吸抑制劑，諸如滅達樂之苯醯胺，諸如普拔克之胺基甲酸酯，諸如扶吉胺之苯基吡啶胺，與諸如四氯異苯、賽座滅、克絕、達滅

芬、座沙米與依普發之其他殺真菌劑。

重要的組合物是，其中成分(b)至少包括一種選自(b1)、(b2)、(b3)、(b4)、(b5)、(b6)、(b7)、(b8)與(b9)之兩種不同類之個別化合物。這些兩種成分(b)類之第一個化合物與這些成分(b)類之第二個化合物之重量比典型地為由100:1至1:100，更典型地為由30:1至1:30，又以由10:1至1:10最為典型。

重要的組合物是，其中成分(b)包括至少一種選自例如鋅錳乃浦之(b1)化合物與至少一種選自，例如(b2)、(b3)、(b6)、(b7)、(b8)或(b9)之第二種成分(b)類之化合物。特別重要的組合物是，那些成分(b)比成分(a)之總體重量比例為由30:1至1:30，而成分(b1)比成分(a)之重量比例係由10:1至1:1之組合物。包括其中成分(b1)比成分(a)之重量比為由9:1至4.5:1之組合物。這些組合物之實例包括含成分(a)(以來自附錄表A之化合物較佳)與鋅錳乃浦與選自包括凡殺、芬那蜜、亞拖敏、克收欣、百克敏、三氟敏、克絕、滅達樂、本達樂、歐殺斯、6-碘-3-丙基-2-丙基氧-4(3H)-喹唑酮、6-氯-2-丙氧基-3-丙基硫烯[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮、氟爾培、蓋普丹與福賽得之混合物的組合物。

亦重要的組合物是，其中成分(b)包括至少一種選自例如凡殺之(b2)化合物與至少一種選自例如(b1)、(b3)、(b6)、(b7)、(b8)或(b9)之第二種成分(b)類之化合物。特別重要的組合物是，其成分(b)比成分(a)之總體重量比例為由30:1至1:30，而成分(b2)比成分(a)之重量比例係由10:1至1:1者。包括

其成分(b2)比成分(a)之重量比為由9：1至4.5：1之組合物。這些組合物之實例包括含成分(a)(以來自附錄表A之化合物較佳)與凡殺與選自包括鋅錳乃浦、錳乃浦、甲基鋅乃浦、辛乃浦、克絕、滅達樂、本達樂、歐殺斯、6-碘-3-丙基-2-丙基氧-4(3H)-喹唑酮、6-氯-2-丙氧基-3-丙基硫烯[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮、氟爾培、蓋普丹與福賽得之混合物的組合物。

亦重要的組合物是，其中成分(b)包括(b3)，換言之即克絕之化合物，與至少一種選自例如(b1)、(b2)、(b6)、(b7)、(b8)或(b9)之第二種成分(b)類之化合物。特別重要的組合物是，其成分(b)比成分(a)之總體重量比例為由30：1至1：30，而成分(b3)比成分(a)之重量比例係由10：1至1：1者。包括其成分(b3)比成分(a)之重量比為由9：1至4.5：1之組合物。這些組合物之實例包括含成分(a)(以來自附錄表A之化合物較佳)與克絕與選自包括凡殺、芬那蜜、亞拖敏、克收欣、百克敏、三氟敏、鋅錳乃浦、錳乃浦、甲基鋅乃浦、辛乃浦、滅達樂、本達樂、歐殺斯、6-碘-3-丙基-2-丙基氧-4(3H)-喹唑酮、6-氯-2-丙氧基-3-丙基硫烯[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮、氟爾培、蓋普丹與福賽得之混合物的組合物。

亦重要的組合物是，其中成分(b)包括至少一種選自(b6)之化合物，例如滅達樂與至少一種選自例如(b1)、(b2)、(b3)、(b7)、(b8)或(b9)之第二種成分(b)類之化合物。特別重要的組合物是，其成分(b)比成分(a)之總體重量比例為由30：1至1：30，而成分(b6)比成分(a)之重量比例係由10：1至1：3者。包括其成分(b6)比成分(a)之重量比為由9：1至4.5：1之

組合物。這些組合物之實例包括含成分(a)(以來自附錄表A之化合物較佳)與滅達樂或歐殺斯與選自包括凡殺、芬那蜜、亞拖敏、克收欣、百克敏、三氟敏、克絕、鋅錳乃浦、錳乃浦、甲基鋅乃浦、辛乃浦、6-碘-3-丙基-2-丙基氧-4(3H)-喹唑酮、6-氯-2-丙氧基-3-丙基硫烯[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮、氟爾培、蓋普丹與福賽得之混合物的組合物。

亦重要的組合物是，其中成分(b)包括至少一種選自(b7)之化合物，例如6-碘-3-丙基-2-丙基氧-4(3H)-喹唑酮或6-氯-2-丙氧基-3-丙基硫烯[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮與至少一種選自例如(b1)、(b2)、(b3)、(b6)、(b8)或(b9)之第二種成分(b)類之化合物。特別重要的組合物是，其成分(b)比成分(a)之總體重量比例為由30：1至1：30，而成分(b7)比成分(a)之重量比例係由1：1至1：20者。包括其成分(b6)比成分(a)之重量比為由1：4.5至1：9之組合物。這些組合物之實例包括含成分(a)(以來自附錄表A之化合物較佳)與6-碘-3-丙基-2-丙基氧-4(3H)-喹唑酮或6-氯-2-丙氧基-3-丙基硫烯[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮與選自包括凡殺、芬那蜜、亞拖敏、克收欣、百克敏、三氟敏、克絕、鋅錳乃浦、錳乃浦、甲基鋅乃浦、辛乃浦、滅達樂、本達樂、歐殺斯、氟爾培、蓋普丹與福賽得之混合物的組合物。

亦重要的組合物是，其中成分(b)包括(b9)之化合物，換言之即福賽得，與至少一種選自例如(b1)、(b2)、(b3)、(b6)或(b7)之第二種成分(b)類之化合物。特別重要的這種組合物是，其成分(b)比成分(a)之總體重量比例為由30：1至1：

30，而成分(b9)比成分(a)之重量比例係由10：1至1：1者。包括其成分(b9)比成分(a)之重量比為由9：1至4.5：1之組合物。這些組合物之實例包括含成分(a)(以來自附錄表A之化合物較佳)與福賽得與選自包括凡殺、芬那蜜、亞拖敏、克收欣、百克敏、三氟敏、鋅錳乃浦、錳乃浦、甲基鋅乃浦、辛乃浦、滅達樂、本達樂、歐殺斯、6-碘-3-丙基-2-丙基氧-4(3H)-噻唑酮、6-氯-2-丙氧基-3-丙基硫烯[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮、氟爾培、蓋普丹與克絕之混合物的組合物。

重要的是式I化合物與給予更廣效性之農業保護的殺真菌劑，包括諸如亞拖敏、克收欣、百克敏與三氟敏之史拖比，諸如芬普定與芬普莫之嗎福啉，諸如溴克座、環克座、待克利、依普座、護矽得、易克座、麥克座、普克利、得克利與崔克座之三唑，嘧啶酮殺真菌劑免賴得，貝芬替，四氯異苯，達滅芬，氟爾培，鋅錳乃浦，錳乃浦，快諾芬，微利黴素與免克寧之組合。

較佳之4。較佳組合物包括混合以克絕之成分(a)化合物者。

較佳之5。較佳組合物包括混合選自(b1)的化合物之成分(a)。化合物者。更佳之組合物係其中(b1)化合物為鋅錳乃浦者。

較佳之6。較佳組合物包括混合選自(b2)的化合物之成分(a)。化合物者。更佳之組合物係其中(b2)化合物為凡殺者。

應特別注意的是化合物2或3與亞拖敏之組合，化合物2或3與克收欣之組合，化合物2或3與百克敏之組合，化合

物 2 或 3 與 三 氟 敏 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 貝 芬 替 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 四 氯 異 苯 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 達 滅 芬 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 氟 爾 培 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 鋅 錳 乃 浦 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 錳 乃 浦 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 快 諾 芬 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 微 利 黴 素 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 免 克 寧 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 芬 普 定 e 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 芬 普 莫 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 溴 克 座 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 環 克 座 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 待 克 利 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 依 普 座 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 護 矽 得 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 易 克 座 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 麥 克 座 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 普 克 利 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 得 克 利 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 崔 克 座 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 凡 殺 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 芬 那 蜜 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 免 賴 得 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 克 絕 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 福 賽 得 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 滅 達 樂 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 甲 基 鋅 乃 浦 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 辛 乃 浦 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 硫 酸 銅 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 氫 氧 化 銅 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 普 拔 克 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 賽 座 滅 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 座 沙 米 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 扶 吉 胺 之 組 合，化 合 物 2 或 3 與 依 普 發 之 組 合。化 合 物 號 碼 表 示 附 錄 表 A 之 化 合 物。

配 方 / 用 途

本發明之組合物通常做為配方或組合物之用途，包括至少一種選自農業適當液體稀釋劑、固體稀釋劑與介面活性

劑之載體。配方或組合物成分之選取應與活性成分之物理性質、施用模式與諸如土壤型態、溼度與溫度之環境因子一致。有用的配方包括諸如溶液(包括乳化濃縮液)、懸浮液、乳液(包括微乳液與/或懸浮乳劑)及其得視情形濃縮成膠之類似物之液體。有用的配方進一步包括諸如粉劑、散劑、顆粒、凝塊、錠劑、薄膜及其水分散(可濕潤的)或水溶性之類似物的固體。得將活性成分(微)裝成膠囊並進一步形成懸浮液或固體配方,另外亦得將整個活性成分配方裝成膠囊(或"整體塗覆")。裝成膠囊可控制或延遲活性成分之釋放。噴霧配方得在適當媒介中延展,且使用之噴霧體積為每公頃由一至數百公升。高強度組合物主要係做為進一步配方之中間體使用。

該配方在下列可將重量加至100%之概略範圍內典型地包含有效量(例如由0.01-99.99%重量百分比)之活性成分,加上稀釋劑與/或介面活性劑。

	重量百分比		
	<u>活性成分</u>	<u>稀釋劑</u>	<u>介面活性劑</u>
水分散與水溶性顆粒、錠劑與散劑	5-90	0-94	1-15
懸浮液、乳液、溶液(包括乳化濃縮液)	5-50	40-95	0-25
粉劑	1-25	70-99	0-5
顆粒與凝塊	0.01-99	5-99.99	0-15
高強度組合物	90-99	0-10	0-2

典型的固體稀釋劑係如 Watkins 等人., 於 Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 第2版, Dorland Books, Galdwell, New Jersey

所述者。典型的液體稀釋劑係如 Marsden, 於 Solvents Guide , 第 2 版 , Interscience, New York, 1950 所述者。 McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, Allured Publ. Corp., Ridgewood, New Jersey, 以及 Sisely 與 Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964 列出介面活性劑並推薦用途。全部配方皆得包含少量添加物以降低泡沫、凝塊、腐蝕、微生物生長及其類似者, 或濃稠劑以增加粘度。

介面活性劑包括例如, 聚乙氧基醇、聚乙氧基烷基酚、聚乙氧基山梨聚糖脂肪酸酯、二烷基硫琥珀酸酯、烷基硫酸酯、烷基苯磺酸酯、有機矽酮、N,N-二烷基牛磺酸酯、木質素磺酸酯、萘磺酸酯甲醛凝結物、聚羧酸酯與聚氧乙烯/聚氧丙烯塊狀共聚物。固體稀釋劑包括例如諸如膨潤土、蒙特石、凹凸棒石、高嶺土等之黏土, 澱粉、糖、矽膠、滑石、矽藻土、尿素、碳酸鈣、碳酸鈉與碳酸氫鈉以及硫酸鈉等。液體稀釋劑包括, 例如水、N,N-二甲基甲醯胺、二甲砜、N-烷基吡咯酮、乙二醇、聚丙二醇、石蠟、烷基苯、烷基萘、橄欖油、蓖麻籽油、亞麻油、桐油、芝麻油、玉米油、花生油、棉籽油、大豆油、油菜油與椰子油、脂肪酸酯、諸如環己酮、2-庚酮、異辛酮與 4-羥-4-甲基-2-戊酮之酮類與諸如甲醇、環己醇、癸醇與四氫呋喃甲醇之醇類。

僅利用簡單混合成分, 即可製備包括乳化濃縮液之溶液。利用混合, 通常在粉碎機或液能研磨機中研磨即可製備粉劑與散劑。懸浮液通常係利用濕式研磨例如參照美國

3,060,084製成。較佳懸浮濃縮液亦包括彼除了活性成份外，含5-20%之非離子介面活性劑(例如聚乙氧基脂肪醇)，視情形結合50-65%液體稀釋劑與可達5%之陰離子介面活性劑者。顆粒與凝塊得藉由將活性成分噴霧在預形成之顆粒載體或利用聚結技術製成。參照Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 1967年12月4日，147-48頁，Perry's Chemical Engineer's Handbook，第4版，McGraw-Hill, New York, 1963, 8-57頁與後續者以及WO 91/13546。凝塊得根據美國專利4,172,714所述製成。水分散與水溶性顆粒得根據美國專利4,144,050、美國專利3,920,442與德國專利3,246,493所述製成。錠劑得根據美國專利5,180,587、美國專利5,232,701與美國專利5,208,030所述製成。薄膜得如英國專利2,095,558與美國專利3,299,566所述製成。

為進一步取得有關配方技藝之資訊，請參照美國專例號碼3,235,361，第6欄16行至第7欄19行與實例10-41；美國專例號碼3,309,192，第5欄43行至第7欄62行與實例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138-140、162-164、166、167與169-182；美國專例號碼2,891,855，第3欄66行至第5欄17行與實例1-4；Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, 81-96頁；以及Hance等人；Weed Control Handbook，第8版；Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989。

在下列實例中，所有百分比皆表示重量，而且所有配方皆以傳統方式製成。咸信，無需多花心思，熟諳此藝者即可利用前述說明將本發明發揮至極致。因而，應體認下列實例僅為說明之用；無論如何，絕非做為發明揭示之限制。

(48)

除非特別說明，百分比皆表重量。

實例 A

濕潤性散劑

活性成分	65.0%
十二烷基酚聚乙二醇醚	2.0%
木質素磺酸鈉	4.0%
矽鋁酸鈉	6.0%
蒙特石(煅燒)	23.0%

實例 B

顆粒

活性成分	10.0%
凹凸棒石顆粒(低揮發性物質， 0.71/0.30 毫米；U.S.S. No. 25-50 篩網)	90.0%

實例 C

擠壓凝塊

活性成分	25.0%
無水硫酸鈉	10.0%
粗木質素磺酸鈣	5.0%
烷基萘磺酸鈉	1.0%
膨潤土鈣/鎂	59.0%

實例 D

乳化濃縮液

活性成分	20.0%
油可溶磺酸鹽與聚氧乙烯醚之混合物	10.0%
異辛醇	70.0%

實例 E懸浮濃縮液

活性成分		20.0%
聚乙氧基脂肪醇	非離子介面活性劑	15.0%
二十八烷蠟之酯衍生物		3.0%
木質素磺酸鈣	陰離子介面活性劑	2.0%
聚乙氧基/聚丙氧基		
聚二醇塊狀共聚物	介面活性劑	1.0%
丙二醇	稀釋劑	6.4%
聚(二甲基矽氧烷)	抗泡沫劑	0.6%
抗微生物劑		0.1%
水	稀釋劑	51.9%

將配方成分混在一起做為糖漿，添加活性成分並以攪拌器將混合物均質化。將生成之泥漿濕式研磨以形成懸浮濃縮液。

亦得將本發明組合物混以一或多種其他殺蟲劑、殺線蟲劑、殺菌劑、殺劑、生長調節劑、化學滅菌劑、記號化學物質、拒斥劑、引誘劑、費洛蒙、餵食刺激劑或其他生物活性化合物以形成多成分殺蟲劑俾給予更廣效性之農業保護。此種農業保護劑且本發明組合物得製成配方之實例為：諸如阿巴汀(abamectin)、歐殺松(acephate)、谷速松(azinphos-methyl)、畢芬寧(bifenthrin)、布芬淨(buprofezin)、加保扶(carbofuran)、克凡哌(chlorfenapyr)、陶斯松(chlorpyrifos)、甲

基陶斯松 (chlorpyrifos-methyl)、賽扶寧 (cyfluthrin)、貝它賽扶寧 (β -cyfluthrin)、賽洛寧 (cyhalothrin)、蘭達賽洛寧 (λ -cyhalothrin)、第滅寧 (deltamethrin)、汰芬隆 (diafenthiuron)、大利松 (diazinon)、二福隆 (diflubenzuron)、大滅松 (dimethoate)、芬化利 (esfenvalerate)、撲滅芬普寧 (fenoxycarb)、芬普寧 (fenpropathrin)、芬化利 (fenvalerate)、芬普尼 (fipronil)、護賽寧 (flucythrinate)、福化利 (τ -fluvalinate)、大幅松 (fonophos)、益達鉅 (imidacloprid)、亞芬松 (isofenphos)、馬拉松、聚乙醛 (metaldehyde)、達馬松 (methamidophos)、滅大松 (methidathion)、納乃得 (methomyl)、美拖林 (methoprene)、美所氯 (methoxychlor)、甲基-7-氯-2,5-二氫-2-[[N-(甲氧羰基)-N-[4-(三氟甲氧基)苯基]胺基]羰基]印酮 [1,2-e][1,3,4] 噁二吡 (oxadiazine)-4a(3H)-羧酸酯 (因得克 (indoxacarb))、莫克松 (monocrotophos)、歐殺滅 (oxamyl)、巴拉松、巴拉松-甲基、百滅寧 (permethrin)、福瑞松 (phorate)、裕必松 (phosalone)、益滅松 (phosmet)、福賜米松 (phosphamidon)、比加普 (pirimicarb)、佈飛松 (profenofos)、魚藤經 (rotenone)、殺羅松 (sulprofos)、得芬諾 (tebufenozide)、汰福林 (tefluthrin)、托福松 (terbufos)、四氯文松 (tetrachlorvinphos)、硫迪克 (thiodicarb)、特多寧 (tralomethrin)、三氯松 (trichlorfon) 與崔木隆 (triflumuron) 之殺蟲劑；諸如鏈黴素之殺菌劑；諸如三亞 (amitraz)、滿離丹 (chinomethionat)、克氯苯 (chlorobenzilate)、錫瑞丹 (cyhexatin)、大克瑞 (dicofol)、得氯瞞 (dienochlor)、依殺瑞 (etoxazole)、芬克座 (fenazaquin)、分佈賜 (fenbutatin oxide)、芬普寧 (fenpropathrin)、芬普瑞 (fenpyroximate)、合賽多 (hexythiazox)、歐瑞多 (propargite)、

畢達本 (pyridaben) 與得芬畢 (tebufenpyrad) 之殺劑；諸如阿多卡 (aldoxycarb) 與芬滅松 (fenamiphos) 之殺線蟲劑；與諸如蘇力菌、蘇力菌 δ 內毒素之生物性藥劑；桿狀病毒；昆蟲之病原菌、病毒與真菌等。這些不同混合成分與式 I 化合物之重量比典型地為 100 : 1 至 1 : 100，以 30 : 1 至 1 : 30 較佳，以 10 : 1 至 1 : 10 更佳，又以 4 : 1 至 1 : 4 最佳。

本發明組合物具有植物疾病控制劑之用途。因而，本發明進一步包括控制由真菌之植物病原所造成的植物疾病之方法，包括施予欲保護之植物或其部分，或欲保護之植物種子或其幼苗有效量之本發明組合物。本發明之組合物提供控制由廣範圍之擔子菌 (Basidiomycete)、麥角菌科 (Ascomycete)、卵菌綱、不完全菌 (Deuteromycete) 綱之真菌植物病原所造成的疾病之方法。其在控制廣泛的疾病之上很有效，特別是針對觀賞植物、蔬菜、田野、穀類與水果之植物葉子病原。這些病原包括葡萄露病菌、蕃茄晚疫菌、煙草露病菌 (*Peronospora tabacina*)、瓜類露病菌 (*Pseudoperonospora cubensis*)、胡瓜根腐病菌 (*Pythium aphanidermatum*)、十字花科蔬果黑斑病菌 (*Alternaria brassicae*)、小麥桴枯病菌 (*Septoria nodorum*)、葉斑病菌 (*Septoria tritici*)、晚葉斑病菌 (*Cercosporidium personatum*)、花生褐斑病菌 (*Cercospora arachidicola*)、眼斑病菌 (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、菠菜褐斑病菌 (*Cercospora beticola*)、貴腐黴菌、桃核腐病菌 (*Monilinia fructicola*)、稻熱病菌 (*Pyricularia oryzae*)、蘋果白粉病菌 (*Podosphaera leucotricha*)、蘋果黑星病菌 (*Venturia inaequalis*)、小麥白粉病菌 (*Erysiphe*

graminis)、葡萄白粉病菌、赤銹病菌 (*Puccinia recondita*)、黑銹病菌 (*Puccinia graminis*)、咖啡銹病菌 (*Hemileia vastatrix*)、黃銹病菌 (*Puccinia striiformis*)、花生銹病 (*Puccinia arachidis*)、立枯絲核菌、(*Sphaerotheca fuliginea*)、台灣尖鎌孢菌 (*Fusarium oxysporum*)、楓樹微管束病菌 (*Verticillium dahliae*)、瓜果腐黴菌 (*Pythium aphanidermatum*)、腐根疫病菌 (*Phytophthora megasperma*)、萵苣巨核病菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*)、白絹菌 (*Sclerotium rolfsii*)、綠豆白粉病菌 (*Erysiphe polygoni*)、網斑病菌 (*Pyrenophora teres*)、通吃真菌 (*Gaeumannomyces graminis*)、熱斑病菌 (*Rhynchosporium secalis*)、康乃辛凋萎病菌 (*Fusarium roseum*)、萵苣露菌病 (*Bremia lactucae*) 及其他與這些病原密切相關之屬與種。本發明組合物在控制葡萄之葡萄露病菌與馬鈴薯及蕃茄之蕃茄晚疫菌之上特別有效。

植物疾病控制，通常若非在感染前即是在感染後，藉由施予有效量之本發明化合物於欲保護之植物的部分諸如根、莖、葉、果實、種子、塊莖、球莖或至欲保護之植物生長之媒介(土壤或砂)。本發明之組合物亦得施用於種子以保護種子與幼苗。

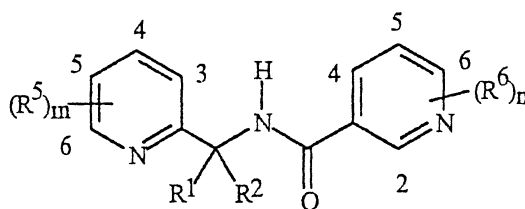
這些化合物之施用比率受諸多環境因素影響，且視實際使用情形而定。通常，以活性成分保護葉子之處理比率由低於1克/公頃至5,000克/公頃。若每公斤種子以0.1-10克比率處理即可保護種子與幼苗。

下列 TESTS 顯示包括本發明組合物對特定病原之控制效果。本發明組合物提供之病原控制保護並不僅限於這些品

(53)

種。參照附錄表 A-B 之 TESTS 中所用之化合物說明。下列附錄表中所用之縮寫如下：Me 為甲基、OMe 為甲氧基。"Ex." 之縮寫表示 "實例"，其附加之數目表示化合物製備所根據之實例。

附錄表 A



化合物編號	R ¹	R ²	(R ⁵) _m	(R ⁶) _n	溶點 (°C.)
1 (Ex. 2) 消旋性	H	CH ₃	3,5-二-Cl	2,4-二-Cl	*
2 (Ex. 1) racemic	H	CH ₃	3-Cl-5-Br	2,4-二-Cl	*
3	H	CH ₃	3-Cl-5-I	2,4-二-Cl	*
4	H	H	3,5-Cl ₂	2,4-二-Cl	*
5	H	CH ₃	3-Cl-5-F	2,4-二-Cl	*
6	H	H	3-Br-5-Cl	2,4-二-Cl	*
7	H	CH ₃	3,5-二-Br	2,4-二-Cl	*
8	H	H	3-I-5-Cl	2,4-二-Cl	*
9	H	H	3-Cl-5-Br	2,4-二-Cl	*
10	H	CH ₃	3,5-二-Me	2,4-二-Cl	*

(54)

化合物編號	R ¹	R ²	(R ⁵) _m	(R ⁶) _p	溶點 (°C.)
11	H	CH ₃	3-Cl-5-OCF ₂ H	2,4-di-Cl	*
12	H	H	3-Cl-5-I	2,4-di-Cl	*
13	H	CH ₃	3-Cl-5-Br	2,4-di-Cl-6-Me	*
14	H	H	3-Cl-5-Br	2,4-di-Cl-6-Me	*
15	H	CH ₃	3-Cl-5-I	2,4-di-Cl-6-Me	8
16	H	H	3-Cl-5-I	2,4-di-Cl-6-Me	*
17	H	H	3,5-di-Br	2,4-di-Cl	*
18	H	H	3,5-di-Br	2,4-di-Cl-6-Me	*
19	H	H	3,5-di-Cl	2,4-di-Cl-6-Me	*
20	H	CH ₃	3,5-di-Cl	2,4-di-Cl-6-Me	*
21	H	CH ₃	3-Cl-5-OMe	2,4-di-Cl-6-Me	*
22	H	CH ₃	3-Cl-5-OMe	2,4-di-Cl	*
23	H	CH ₃	3-I-5-Br	2,4-di-Cl	*
24	H	H	3-Cl-5-Br	2-Cl-4-I	*
25	H	CH ₃	3-Cl-5-Br	2-Cl-4-I	*
26	H	H	3,5-Cl ₂	2-Cl-4-I	*
27	H	CH ₃	3,5-Cl ₂	2-Cl-4-I	*
28	H	CH ₃	3-Cl-5-Br	2-Cl-4-Br	*
29	H	CH ₃	3-Cl-5-Br	2-Br-4-Me	*
30	H	CH ₃	3,5-di-Br	2-Cl-4-I	*
31	H	CH ₃	3,5-di-Br	2-F-4-I	*
32	H	CH ₃	3,5-di-Br	2,4-di-Cl-6-Me	*
33	H	CH ₃	3-Cl-5-Br	2-F-4-I	*
34	H	CH ₃	3-Br-5-Cl	2,4-di-Cl	*
35	H	H	3-Br-5-I	2,4-di-Cl	*
36	H	CH ₃	3-Br-5-I	2,4-di-Cl	*
37	H	CH ₃	3-Cl-5-Br	2-F-4-Br	*
38	H	CH ₃	3,5-di-Cl	2-F-4-Br	*
39	H	CH ₃	3,5-di-Br	2-F-4-Br	*
40	H	H	3-Br-5-Cl	2,4-di-Cl-6-Me	*
41	H	CH ₃	3-Br-5-Cl	2,4-di-Cl-6-Me	*
42	H	H	3-Br-5-I	2,4-di-Cl-6-Me	*
43	H	CH ₃	3-Br-5-I	2,4-di-Cl-6-Me	*

*¹H NMR 請參照附錄表 B

附錄表 B

化合物編號 ¹H NMR 資料(300 MHz; 除非特別說明, 否則即 CDCl₃)^a

1	δ 1.58(d, 3H, J is 6.6 Hz), 5.7-5.8(m, 1H), 7.4(m, 2H), 7.77(m, 1H), 8.35(m, 1H), 8.40(m, 1H).
2	δ 1.59(d, 3H, J is 6.6 Hz), 5.75(m, 1H), 7.3(bs, 1H), 7.34(d, 1H, J is 5.2 Hz), 7.91(d, 1H, J is 1.9 Hz), 8.33(d, 1H, J is 5.4 Hz), 8.49(d, 1H, J is 1.9 Hz).
3	δ 1.58 (d, 3H, J is 6.9 Hz), 5.7 (m, 1 H), 7.35(m, 2 H), 8.70(d, 1 H, J is 1.9), 8.35(m, 1 H), 8.61(d, 1 H, J is 1.9)
4	δ 4.87 (d, 2H, J is 4.3 Hz), 7.36 (d, 1 H, J is 5.5 Hz), 7.79 (d, 1 H, J is 2.2 Hz), 8.35 (d, 1 H, J is 5.2), 8.41(d, 1 H, J is 2.1 Hz)
5	δ 1.58 (d, 3 H, J is 6.6 Hz), 5.75 (m, 1 H), 7.3-7.4 (m, 2 H), 7.55 (m, 1 H), 8.3 (m, 2 H).
6	δ 4.84 (d, 2 H, J is 4.1 Hz), 7.36 (d, 1 H, J is 5.5 Hz), 7.5 (bs, 1 H), 7.95 (d, 1 H, J is 2.0 Hz), 8.35 (d, 1 H, J is 5.5 Hz), 8.44 (d, 1 H, J is 2.0 Hz)
7	δ 1.58 (d, 3 H, J is 6.6 Hz), 5.7 (m, 1 H), 7.3-7.4 (m, 2 H), 8.08 (d, 1 H, J is 2.1 Hz), 8.32 (d, 1 H, J is 5.2 Hz), 8.52 (d, 1 H, J is 2.0 Hz)
8	δ 4.78 (d, 2 H, J is 4.2 Hz), 7.36 (d, 1 H, J is 5.3 Hz), 7.5 (bs, 1 H), 8.18 (d, 1 H, J is 2.1 Hz), 8.35 (d, 1 H, J is 5.3 Hz), 8.45 (d, 1 H, J is 2.2 Hz)
9	δ 4.84 (d, 2 H, J is 4.3 Hz), 7.36 (d, 1 H, J is 5.3 Hz), 7.4 (bs, 1 H), 7.93 (d, 1 H, J is 2.2 Hz), 8.35 (d, 1 H, J is 5.3 Hz), 8.50 (d, 1 H, J is 2.1 Hz)
10	δ 1.53 (d, 3 H, J is 5.6 Hz), 2.29 (s, 3 H), 2.39 (s, 3 H), 5.45 (m, 1 H), 7.32 (m, 2 H), 7.7 (bd, 1 H), 8.16 (m, 1 H), 8.31 (d, 1 H, J is 5.3 Hz)
11	δ 1.58 (d, 3 H, J is 6.6 Hz), 5.75 (m, 1 H), 6.57 (t, 1 H, J is 71.8 Hz), 7.3-7.4 (m, 2 H), 7.60 (d, 1 H, J is 1.7 Hz), 8.33 (m, 2 H)
12	δ 4.84 (d, 2 H, J is 4.3 Hz), 7.36 (d, 1 H, J is 5.5 Hz), 7.4 (bs, 1 H), 8.07 (d, 1 H, J is 1.7 Hz), 8.35 (m, 2 H), 8.64 (d, 1 H, J is 1.5 Hz)
13	δ 1.57 (d, 3 H, J is 6.5 Hz), 2.55 (s, 3 H), 5.7 (m, 1 H), 7.18 (s, 1 H), 7.3 (bd, 1 H), 7.9 (d, 1 H, J is 2.0 Hz), 8.48 (d, 1 H, J is 1.8 Hz)
14	δ 2.58 (s, 3 H), 4.83 (d, 2 H, J is 4.3 Hz), 7.21 (s, 1 H), 7.4 (bs, 1 H), 7.92 (d, 1 H, J is 2.1 Hz), 8.49 (d, 1 H, J is 1.8 Hz)
15	δ 1.57 (d, 3 H, J is 7.2 Hz), 2.55 (s, 3 H), 5.7 (m, 1 H), 7.18 (s, 1 H), 7.3 (bd, 1 H, J is 8.2 Hz), 8.06 (d, 1 H, J is 1.7 Hz), 8.61 (d, 1 H, J is 1.7 Hz)
16	δ 2.56 (s, 3 H), 4.82 (d, 2 H, J is 4.1 Hz), 7.21 (s, 1 H), 7.4 (bs, 1 H), 8.07 (d, 1 H, J is 1.9 Hz), 8.62 (d, 1 H, J is 1.6 Hz)
17	δ 4.82 (d, 2 H, J is 4.3 Hz), 7.36 (d, 1 H, J is 5.5 Hz), 7.47 (bs, 1 H), 8.09 (d, 1 H, J is 2.0 Hz), 8.35 (d, 1 H, J is 5.5 Hz), 8.53 (d, 1 H, J is 2.0 Hz)
18	δ 2.56 (s, 3 H), 4.80 (d, 2 H, J is 4.1 Hz), 7.21 (s, 1 H), 7.41 (bs, 1 H), 8.09 (d, 1 H, J is 2.1 Hz), 8.53 (d, 1 H, J is 1.9 Hz)
19	δ 2.56 (s, 3 H), 4.85 (d, 2 H, J is 4.3 Hz), 7.21 (s, 1 H), 7.40 (bs, 1 H), 7.78 (d, 1 H, J is 2.1 Hz), 8.40 (d, 1 H, J is 2.0 Hz)
20	δ 1.57 (d, 3 H, J is 6.6 Hz), 2.55 (s, 3 H), 5.7 (m, 1 H), 7.19 (s, 1 H), 7.30 (bd, 1 H), 7.76 (d, 1 H, J is 2.0 Hz), 8.39 (d, 1 H, J is 2.1 Hz)
21	δ 1.56 (d, 3 H, J is 7.4 Hz), 2.54 (s, 3 H), 3.86 (s, 3 H), 5.7 (m, 1 H), 7.18 (s, 1 H), 7.24 (m, 1 H), 7.4 (bd, 1 H), 8.12 (d, 1 H, J is 2.6 Hz)
22	δ 1.57 (d, 3 H, J is 6.6 Hz), 3.87 (s, 3 H), 5.7 (m, 1 H), 7.27 (m, 1 H), 7.33 (d, 1 H, J is 5.4 Hz), 7.45 (bd, 1 H), 8.12 (d, 1 H, J is 2.6 Hz), 8.32 (d, 1 H, J is 5.2 Hz)
23	δ 1.58 (d, 3 H, J is 6.6 Hz), 5.7 (m, 1 H), 7.35 (d, 1 H, J is 5.5 Hz), 7.35 (bs, 1 H), 8.24 (d, 1 H, J is 1.6 Hz), 8.33 (d, 1 H, J is 5.4 Hz), 8.64 (d, 1 H, J is 1.7 Hz)
24	δ 4.84 (d, 2 H, J is 4.3 Hz), 7.4 (bs, 1 H), 7.75 (d, 1 H, J is 5.2 Hz), 7.92 (d, 1 H, J is 1.9 Hz), 8.04 (d, 1 H, J is 5.2 Hz), 8.50 (d, 1 H, J is 2.0 Hz)
25	δ 1.60 (d, 3 H, J is 6.6 Hz), 5.7 (m, 1 H), 7.3 (bd, 1 H), 7.73 (d, 1 H, J is 5.3 Hz), 7.91 (d, 1 H, J is 2.0 Hz), 8.03 (d, 1 H, J is 5.1 Hz), 8.50 (d, 1 H, J is 1.9 Hz)
26	δ 4.86 (d, 2 H, J is 4.3 Hz), 7.46 (bs, 1 H), 7.75 (d, 1 H, J is 5.2 Hz), 7.79 (d, 1 H, J is 2.1 Hz), 8.04 (d, 1 H, J is 5.3 Hz), 8.41 (d, 1 H, J is 2.0 Hz)
27	δ 1.6 (d, 3 H), 5.7 (m, 1 H), 7.4 (bs, 1 H), 7.7 (m, 1 H), 7.8 (m, 1 H), 8.01 (s, 1 H), 8.40 (s, 1 H)
28	δ 1.59 (d, 3 H, J is 5.8 Hz), 5.7 (m, 1 H), 7.3 bs, 1 H), 7.5(m, 1 H), 7.9 (m, 1 H), 8.2 (m, 1 H), 8.45 (m, 1 H)

化合物編號 ¹H NMR 資料(300 MHz; 除非特別說明, 否則即 CDCl₃)^a

29	δ 1.58 (d, 3 H, J is 6.8 Hz), 2.36 (s, 3 H), 5.7 (m, 1 H), 7.13 (d, 1 H, J is 5.0 Hz), 7.2 (bd, 1 H), 7.91 (d, 1 H, J is 1.9 Hz), 8.25 (d, 1 H, J is 5.1 Hz), 8.48 (d, 1 H, J is 1.9 Hz)
30	δ 1.60 (d, 3 H, J is 6.7 Hz), 5.7 (m, 1 H), 7.3 (bs, 1 H), 7.73 (d, 1 H, J is 5.3 Hz), 8.02 (d, 1 H, J is 5.0 Hz), 8.08 (d, 1 H, J is 2.1 Hz), 8.53 (d, 1 H, J is 1.8 Hz)
31	δ 1.59 (d, 3 H, J is 6.5 Hz), 5.7 (m, 1 H), 7.4 (bd, 1 H), 7.70 (m, 1 H), 7.89 (d, 1 H, J is 5.2 Hz), 8.08 (d, 1 H, J is 2.0 Hz), 8.53 (d, 1 H, J is 1.8 Hz)
32	δ 1.58 (d, 3 H, J is 6.6 Hz), 2.55 (s, 3 H), 5.7 (m, 1 H), 7.18 (s, 1 H), 7.29 (bd, 1 H), 8.07 (d, 1 H, J is 1.9 Hz), 8.51 (d, 1 H, J is 2.1 Hz)
33	δ 1.58 (d, 3 H, J is 6.6 Hz), 5.7 (m, 1 H), 7.4 (bd, 1 H), 7.70 (d of d, 1 H, J is 0.9, 52. Hz), 7.91 (m, 2 H), 8.50 (d, 1 H, J is 2.1 Hz)
34	δ 1.58 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 5.72 (m, J = 6.6 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 7.38 (broad s, 1H), 7.93 (d, 2.1 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 8.42 (d, J = 2.1 Hz, 1H).
35	δ: 4.80 (d, J = 5 Hz, 2H), 7.35 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 7.49 (broad S, 1H), 8.24 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 8.35 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 8.66 (d, J = 1.9 Hz, 1H).
36	δ: 1.58 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 5.69 (m, J = 6.6 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 7.36 (broad s, 1H), 8.24 (d, 1.7 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 1.7 Hz, 1H).
37	δ: 1.57 (d, 3 H, J is 6.5 Hz), 5.7 (m, 1 H), 7.4 (bd, 1 H), 7.47 (m, 1 H), 7.91 (d, 1 H, J is 2.0 Hz), 8.09 (m, 1 H), 8.49 (d, 1 H, J is 2.1 Hz)
38	δ: 1.58 (d, 3 H, J is 6.5 Hz), 5.7 (m, 1 H), 7.4 (bd, 1 H), 7.46 (d, 1 H, J is 5.5 Hz), 7.77 (d, 1 H, J is 2.0 Hz), 8.09 (d, 1 H, J is 5.4 Hz), 8.40 (d, 1 H, J is 2.1 Hz)
39	δ: 1.58 (d, 3 H, J is 6.6 Hz), 5.65 (m, 1 H), 7.4 (bd, 1 H), 7.46 (m, 1 H), 8.1 (m, 2 H), 8.52 (d, 1 H, J is 2.1 Hz)
40	δ: 2.55 (s, 3H), 4.81 (d, J = 4.5 Hz, 2H), 7.20 (s, 1H), 7.51 (broad S, 1H), 7.94 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.42 (d, J = 2.1 Hz, 1H).
41	δ: 1.57 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 2.54 (s, 3H), 5.73 (m, J = 6.7 Hz, 1H), 7.18 (s, 1H), 7.33 (broad d, 1H), 7.93 (d, 2.1 Hz, 1H), 8.41 (d, J = 2.1 Hz, 1H).
42	δ: 2.55 (s, 3H), 4.78 (d, J = 4.3 Hz, 2H), 7.20 (s, 1H), 7.46 (broad S, 1H), 8.23 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.65 (d, J = 1.8 Hz, 1H).
43	δ: 1.57 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 2.54 (s, 3H), 5.68 (m, J = 6.5 Hz, 1H), 7.18 (s, 1H), 7.34 (broad d, 1H), 8.23 (d, 1.8 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 1.8 Hz, 1H).

^a¹H NMR 資料係以四甲基矽烷之高磁場方向 ppm 表示。偶合之表示：
(s)-單峰, (d)-雙峰, (t)-三峰, (g)-四峰, (m)-多峰, (dd)-雙重雙峰,
(dt)-雙重三峰, (brs)廣單峰。

本發明之生物性實例

製備測試懸浮液之一般方法：首先溶測試化合物於丙酮至等於 3% 終體積之量，然後懸浮於含 250 ppm 介面活性劑 Trem® 014(多元醇酯)之丙酮與水(50/50 混合物)成所需濃度(ppm)。然後於下列測試中使用此生成之測試懸浮液。噴灑 200 ppm 之測試懸浮液於測試植物至比賽點時，即相當於 500 克/公頃之比率。

測試 A

噴灑測試懸浮液於小麥幼苗至比賽點。隔天時以小麥白粉病菌(小麥白粉病之病源)之孢子粉劑接種幼苗並保溫於20℃之生長箱7天，其後即進行疾病分級。

測試 B

噴灑測試懸浮液於小麥幼苗至比賽點。隔天時以赤銹病菌(小麥葉銹病之病源)之孢子懸浮液接種幼苗並保溫於20℃之飽和氣壓24小時，然後移入20℃之生長箱6天，其後即進行疾病分級。

測試 C

噴灑測試懸浮液於稻米幼苗至比賽點。隔天時以稻熱病菌(*Pyricularia oryzae*)(水稻稻熱病之病源)之孢子懸浮液接種幼苗並保溫於27℃之飽和氣壓24小時，然後移入30℃之生長箱5天，其後即進行疾病分級。

測試 D

噴灑測試懸浮液於蕃茄(或馬鈴薯)幼苗至比賽點。隔天時以蕃茄晚疫病(馬鈴薯與蕃茄晚疫之病源)之孢子懸浮液接種幼苗並保溫於20℃之飽和氣壓24小時，然後移入20℃之生長箱5天，其後即進行疾病分級。

測試 E

噴灑測試懸浮液於葡萄幼苗至比賽點。隔天時以葡萄露病菌(葡萄露菌病之病源)之孢子懸浮液接種幼苗並保溫於20℃之飽和氣壓24小時，移入20℃之生長箱6天，然後並保溫於20℃之飽和氣壓24小時，其後即進行疾病分級。

測試 F

以蕃茄晚疫菌(馬鈴薯與蕃茄晚疫之病源)之孢子懸浮液接種馬鈴薯幼苗並保溫於20℃之飽和氣壓24小時。隔天噴灑測試懸浮液至比賽點，然後將接受治療之植物移入20℃之生長箱5天，其後即進行疾病分級。

測試 G

以葡萄露病菌(葡萄露菌病之病源)之孢子懸浮液接種幼苗並保溫於20℃之飽和氣壓24小時。隔天噴灑測試懸浮液至比賽點，然後將接受治療之植物移入20℃之生長箱6天，然後並保溫於20℃之飽和氣壓24小時，其後即進行疾病分級。

測試 A-G之結果列於表 A。表中 100 之級數表示 100% 疾病控制，而 0 之級數表示無法控制疾病(相對於對照組)。(-)表示無測試結果。

表 A

化合物編號	測試 A	測試 B	測試 C	測試 D	測試 E	測試 F#	測試 G
1	0	38	0	100	99	87	100
2	0	19	0	100	100	93	100
3	0	19	-	100	95	88	100
4	0	9	-	100	70	100	100
5	0	0	-	100	70	100	99
6	0	0	-	100	70	100	99
7	0	45	-	100	100	100	100
8	0	0	-	100	100	100	36
9	0	9	-	100	88	99	99
10	0	0	-	99	57	0	0
11	0	0	-	100	100	93	100
12	0	0	-	100	59	98	63
13	0	68	-	100	100	100	100
14	0	41	-	100	100	98	100
15	0	0	-	100	100	70	100
16	0	32	-	100	100	83	95
17	0	-	-	100	99	73	98
18	0	-	-	100	100	77	100
19	0	-	-	99	100	0	100
20	0	-	-	100	100	53	100
21	0	-	-	99	100	53	77
22	0	-	-	100	100	98	94
23	0	-	-	100	100	98	96
24	0	-	-	100	100	0	84
25	0	-	-	100	100	0	72
26	0	-	-	100	81	0	99
27	0	-	-	100	100	0	100
28	0	-	-	99	100	100	100
29	0	-	-	99	100	57	94
30	0	-	-	100	100	44	93
31	0	-	-	100	100	79	100
32	0	-	-	100	100	82	99
33	0	-	-	100	100	100	100
34	0	-	-	100	100	99	100
35	0	-	-	100#	99*	96	50*
36	0	-	-	100#	100*	92	92*
37	0	-	-	100	100	100	100
38	0	-	-	100	100	100	100
39	0	-	-	100	100	100	100
40	0	-	-	100	100	95	99
41	0	-	-	100	100	97	100
42	0	-	-	100	100	93	100
43	0	-	-	100	100	90	100

#100 克/公頃噴灑小麥幼苗 *比率 100 克/公頃

增效效應經描述成"一種混合物中兩種成分(例如成分(a)與成分(b))之合作效果,使總效果比該兩種(或多種)獨立時總合之效果更大或更長"(參照 Tames, P. M. L., Neth. J. Plant Pathology, 1964, 70, 73-80)。經發現含式 I 化合物之組合物與具

有不同作用模式之殺真菌劑展現增效效果。

我們係藉 Colby 方程式建立兩種活性成分間之增效效應 (參照 Colby, S. R. 之 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，首先根據兩種成分個別施用時之活性計算混合物之預測活性，p，藉此建立兩種活性成分間之增效效應。若 p 比實驗建立之效果低即有增效效應。在上述方程式中，A 為第一種成分以 x 比率單獨施用時之殺真菌活性的控制百分比。B 為第二種成分以 y 比率單獨施用時之殺真菌活性的控制百分比。該方程式估計值 p 為假設 A 與 B 的效果為絕對加乘且不會發生交互作用下，比率 x 的 A 與比率 y 的 B 所產生之混合物的殺真菌活性。

得使用下列 TESTS 以顯示本發明組合物對特定病源之控制效果。然而，該化合物提供之病源控制保護並不限於這些品種。

噴灑包括單一活性成分之測試懸浮液以顯示個別活性成分之控制效果。為顯示一種組合之控制效果，(a) 得採適當量將該活性成分結合成單一測試懸浮液、(b) 得製備個別活性成分之貯存溶液，然後以適當比率混合併稀釋至終濃度以形成測試懸浮液與 (c) 得依次以所需比例噴灑包括單一活性成分之測試懸浮液。

(61)

組合物 1

成分	重量 %
化合物 2 技術原料	20
聚乙氧基硬脂醇	15
二十八烷蠟酯	3
去糖木質素磺酸鈣	2
聚氧丙烯-聚氧乙烯塊狀共聚物	1
丙二醇	6.4
聚有基矽氧烷 + 乳化劑	0.6
19%(1,2-苯并異噻唑啉-3-酮)之二丙二醇水溶液	0.1
水	51.9

組合物 2

成分	重量 %
化合物 3 技術原料	20
聚乙氧基硬脂醇	15
二十八烷蠟酯	3
去糖木質素磺酸鈣	2
聚氧丙烯-聚氧乙烯塊狀共聚物	1
丙二醇	6.4
聚有基矽氧烷 + 乳化劑	0.6
19%(1,2-苯并異噻唑啉-3-酮)之二丙二醇水溶液	0.1
水	51.9

組合物 4

成分	重量 %
凡殺技術原料	51.7
木質素磺酸鈉	36.0
烷基萘磺酸鈉	2.0
聚乙烯吡咯啉酮	4.0
聚氧丙烯-聚氧乙烯塊狀共聚物	3.0
十二烷基苯磺酸鈉	3.0
氟烷基酸混合物	0.3

組合物 5

成分	重量 %
克絕技術原料	61.9
烷基萘磺酸鈉 甲醛凝結物	5.0
烷基萘磺酸鈉	1.0
聚乙烯吡咯啉酮	4.0
磷酸二氫鈉	4.0
反丁烯二酸	1.0
白碳黑 (fumed silica)	1.0
鈉	0.2
糖	14.0
木質素硫酸鈉	7.9

首先將測試組合物混合以包含 250 ppm 之介面活性劑 Trem®

014(多元醇酯)之純水。然後於下列測試使用此生成之測試懸浮液。噴灑活性成分當量比率5、10、20、25、50或100克/公頃之測試懸浮液於測試植物至比賽點。噴灑40 ppm測試懸浮液於測試植物至比賽點即相當於100克/公頃之比率。重複測試三次並將結果寫成三次重複測試之平均。

測試H(蕃茄晚疫菌之預防控制)

噴灑測試懸浮液於馬鈴薯幼苗至比賽點。隔天以蕃茄晚疫菌(馬鈴薯與蕃茄晚疫病之病源)之孢子懸浮液接種幼苗並保溫於20℃之飽和氣壓24小時，然後移入20℃之生長箱5天，其後即進行疾病分級。

測試I(蕃茄晚疫菌之治療控制)

施用前24小時先以蕃茄晚疫菌(馬鈴薯與蕃茄晚疫病之病源)之孢子懸浮液接種馬鈴薯幼苗並保溫於20℃之飽和氣壓24小時。然後將測試懸浮液噴灑於馬鈴薯幼苗至比賽點。隔天，將幼苗移入20℃之生長箱5天，其後即進行疾病分級。

測試J(蕃茄晚疫菌之延長預防控制)

噴灑測試懸浮液於馬鈴薯幼苗至比賽點。6天後，以蕃茄晚疫菌(馬鈴薯與蕃茄晚疫病之病源)之孢子懸浮液接種幼苗並保溫於20℃之飽和氣壓24小時，然後移入20℃之生長箱5天，其後即進行疾病分級。

測試H-M之結果列於表B。表中100之級數表示100%疾病控制，而0之級數表示無法控制疾病(相對於對照組)。標示Avg之欄表示三重覆之平均。標示Exp之欄表示利用Colby

方程式計算之每個治療混合物的期望值。測試結果顯示控制組大於期望值者皆以*表示。

表 B

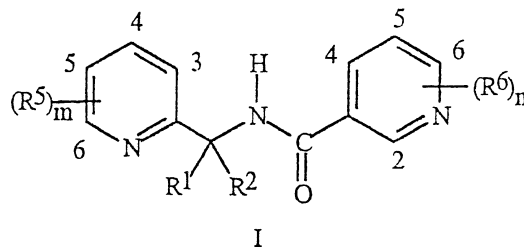
化合物編號	比率	測試 H		測試 I		測試 J	
		平均	Exp	Avg	Exp	Avg	Exp
1	5	0	xx	0	xx	0	xx
1	10	72	xx	0	xx	21	xx
1	20	97	xx	0	xx	47	xx
2	5	0	xx	0	xx	0	xx
2	10	47	xx	0	xx	32	xx
2	20	100	xx	0	xx	82	xx
3	25	100	xx	0	xx	0	xx
3	50	100	xx	0	xx	0	xx
3	100	100	xx	0	xx	0	xx
4	25	0	xx	0	xx	0	xx
4	50	0	xx	0	xx	0	xx
4	100	32	xx	0	xx	0	xx
1+3	5+25	100	100	0	0	9	0
1+3	10+50	100	100	0	0	9	21
1+3	20+100	98	100	0	0	76*	47
1+4	5+25	0	0	0	0	21*	0
1+4	10+50	32	72	9	0	77*	21
1+4	20+100	100	98	29*	0	65*	47
2+3	5+25	100	100	0	0	69*	0
2+3	10+50	100	100	0	0	72*	32
2+3	20+100	100	100	0	0	99*	82
2+4	5+25	24	0	0	0	9	0
2+4	10+50	98*	47	0	0	75*	32
2+4	20+100	100	100	9	0	99*	82

根據 Colby 所發展之對增效效應的說明，經發現本發明之組合物具有增效用處。甚且，施用於欲保護之作物之前，得很方便地將單獨包括成分(a)與成分(b)之組合物與視情形之稀釋劑混合。據此，本發明提供對抗真菌，尤其是馬鈴薯、葡萄與蕃茄之真菌的改良方法，特別是諸如疫菌屬與葡萄露菌屬之卵菌綱之真菌。

肆、中文發明摘要

本發明係關於控制由真菌性植物病原造成之植物疾病之組合物，其包括：

(a)至少一種式I化合物，包括其全部幾何與立體異構物，*N*-氧化物及農業上適當之鹽：



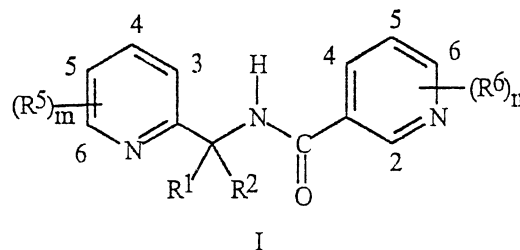
其中 R^1 、 R^2 、 R^5 與 R^6 、 m 及 n 係如本揭示所定義者；與

(b)至少一種選自由下列組成之群之化合物：(b1)伸烷基雙(二硫代胺基甲酸鹽)殺真菌劑、(b2)作用於真菌粒線體呼

伍、英文發明摘要

Compositions for controlling plant diseases caused by fungal plant pathogens are described, comprising:

(a) at least one compound of Formula I, including all geometric and stereoisomers, *N*-oxides and agriculturally suitable salts thereof:



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

(b) at least one compound selected from the group consisting of (b1) alkylenebis(dithiocarbamate) fungicides; (b2) compounds acting at the bc_1 complex of the fungal mitochondrial respiratory electron transfer site; (b3) cymoxanil; (b4) compounds acting at the demethylase enzyme of the sterol biosynthesis pathway; (b5) morpholine and

吸電子傳遞位置之 bc_1 複合體的化合物、(b3)克絕(cymoxanil)、(b4)作用於固醇生化合成代謝路徑之去甲基酶的化合物、(b5)作用於固醇生化合成代謝路徑之嗎福啉與哌啶化合物、(b6)苯醯胺殺真菌劑、(b7)嘧啶酮殺真菌劑、(b8)鄰苯二甲醯亞胺與(b9)福賽得(fosetyl-aluminum)。

本文亦揭示涉及施用所述之有效量組合以控制由真菌性植物病原造成之植物疾病之方法。

本文亦揭示某些式I之新穎化合物。

piperidine compounds that act on the sterol biosynthesis pathway; (b6) phenylamide fungicides; (b7) pyrimidinone fungicides; (b8) phthalimides; and (b9) fosetyl-aluminum.

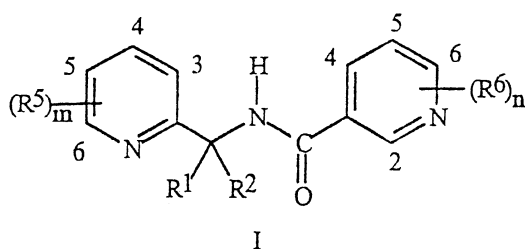
Also disclosed are methods for controlling plant diseases caused by fungal plant pathogens that involves applying an effective amount of the combinations described.

Also disclosed are certain novel compounds of Formula I.

拾、申請專利範圍

1. 一種控制由真菌性植物病原造成之植物疾病之組合物，其包括：

(a) 至少一種式 I 化合物，其 *N*-氧化物與農業上適當之鹽類



其中

R^1 與 R^2 各自獨立為 H 或 C_1 - C_6 烷基，

每個 R^5 獨立為 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 鹵環烷基、鹵素、CN、 CO_2H 、 $CONH_2$ 、 NO_2 、羥基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷亞硫基、 C_1 - C_4 烷磺基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷亞硫基、 C_1 - C_4 鹵烷磺基、 C_1 - C_4 烷胺基、 C_2 - C_8 二烷胺基、 C_3 - C_6 環烷胺基、 C_2 - C_6 烷羰基、 C_2 - C_6 烷氧羰基、 C_2 - C_6 烷胺羰基、 C_3 - C_8 二烷胺羰基或 C_3 - C_6 三烷矽烷基，

每個 R^6 獨立為 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 鹵環烷基、鹵素、CN、 CO_2H 、 $CONH_2$ 、 NO_2 、羥基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、

C₁-C₄烷亞硫鹽基、C₁-C₄烷磺鹽基、C₁-C₄鹵烷硫基、
C₁-C₄鹵烷亞硫鹽基、C₁-C₄鹵烷磺鹽基、C₁-C₄烷胺基、
C₂-C₈二烷胺基、C₃-C₆環烷胺基、C₂-C₆烷羰基、C₂-C₆
烷氧羰基、C₂-C₆烷胺羰基、C₃-C₈二烷胺羰基、C₃-C₆
三烷矽烷基，而

m及n獨立為1、2、3或4，以及

(b)至少一種化合物係選自由下列組成之群：

(b1)伸烷基雙(二硫代胺基甲酸鹽)殺真菌劑，

(b2)作用於真菌粒線體呼吸電子傳遞位置之bc₁複合體
之化合物，

(b3)克絕(cymoxanil)，

(b4)作用於固醇生化合成代謝路徑之去甲基酶之化合物，

(b5)作用於固醇生化合成代謝路徑之嗎福啉及哌啶化
合物，

(b6)苯醯胺殺真菌劑，

(b7)嘧啶酮殺真菌劑，

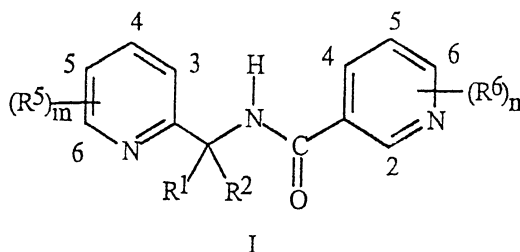
(b8)鄰苯二甲醯亞胺與

(b9)福賽得(fosetyl-aluminum)。

2. 根據申請專利範圍第1項之組合物，其中成分(b)比成分(a)
之重量比率為由9：1至4.5：1。
3. 根據申請專利範圍第2項之組合物，其中成分(b)為克
絕。
4. 根據申請專利範圍第2項之組合物，其中成分(b)係選自

- (b1)之化合物。
5. 根據申請專利範圍第4項之組合物，其中成分(b)為鋅錳乃浦(mancozeb)。
 6. 根據申請專利範圍第2項之組合物，其中成分(b)係選自(b2)之化合物。
 7. 根據申請專利範圍第6項之組合物，其中成分(b)為凡殺(famoxadone)。
 8. 根據申請專利範圍第1項之組合物，其中成分(b)包括選自(b1)、(b2)、(b3)、(b4)、(b5)、(b6)、(b7)、(b8)及(b9)之兩種不同類之各至少一種化合物。
 9. 根據申請專利範圍第8項之組合物，其中成分(b)包括至少一種選自(b1)之化合物與至少一種選自(b2)、(b3)、(b6)、(b7)、(b8)與(b9)之化合物；其中，成分(b)比成分(a)之總重量比例為由30：1至1：30，而成分(b1)比成分(a)之重量比例係由10：1至1：1。
 10. 根據申請專利範圍第8項之組合物，其中成分(b)包括至少一種選自(b2)之化合物與至少一種選自(b1)、(b3)、(b6)、(b7)、(b8)或(b9)之化合物；其中，成分(b)比成分(a)之總重量比例為由30：1至1：30，而成分(b2)比成分(a)之重量比例係由10：1至1：1。
 11. 根據申請專利範圍第8項之組合物，其中成分(b)包括克絕與至少一種選自(b1)、(b2)、(b6)、(b7)、(b8)或(b9)之化合物；其中，成分(b)比成分(a)之總重量比例為由30：1至1：30，而克絕比成分(a)之重量比例係由10：1至1：1。

12. 一種控制由真菌性植物病原造成之植物疾病之方法，包括施予植物或其部份，或植物種子或幼苗有效量之根據申請專利範圍第1項之組合物。
13. 根據申請專利範圍第12項之方法，其中該欲控制之疾病係由真菌病原蕃茄晚疫菌 (*Phytophthora infestans*) 所引起。
14. 根據申請專利範圍第12項之方法，其中該欲控制之疾病係由真菌病原葡萄露病菌 (*Plasmopara viticola*) 所引起。
15. 一種式 I 化合物，包含其所有幾何與立體異構物、N-氧化物與農業上適當之鹽類：



其中

R^1 與 R^2 各自獨立為 H 或 C_1 - C_6 烷基，

每個 R^5 獨立為 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 烷環基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 鹵環烷基、鹵素、CN、 CO_2H 、 $CONH_2$ 、 NO_2 、羥基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷亞硫鹽基、 C_1 - C_4 烷磺鹽基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷亞硫鹽基、 C_1 - C_4 鹵烷磺鹽基、 C_1 - C_4 烷胺基、 C_2 - C_8 二烷胺基、 C_3 - C_6 環烷胺基、 C_2 - C_6 烷羰基、 C_2 - C_6 烷氧羰基、 C_2 - C_6 烷胺羰基、 C_3 - C_8 二烷胺羰基或 C_3 - C_6 三烷

矽烷基，

每個 R^6 獨立為 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 鹵炔基、 C_3-C_6 鹵環烷基、鹵素、CN、 CO_2H 、 $CONH_2$ 、 NO_2 、羥基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷亞硫鹽基、 C_1-C_4 烷磺鹽基、 C_1-C_4 鹵烷硫基、 C_1-C_4 鹵烷亞硫鹽基、 C_1-C_4 鹵烷磺鹽基、 C_1-C_4 烷胺基、 C_2-C_8 二烷胺基、 C_3-C_6 環烷胺基、 C_2-C_6 烷羰基、 C_2-C_6 烷氧羰基、 C_2-C_6 烷胺羰基、 C_3-C_8 二烷胺羰基、 C_3-C_6 三烷矽烷基，其限制條件為至少有一個 R^6 為碘，而

m 及 n 獨立為 1、2、3 或 4。

陸、(一)、本案指定代表圖為：第____圖

(二)、本代表圖之元件代表符號簡單說明：

柒、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

