公告本

申請日期	84.5.13
案號	88107745
類別	C07D207/40, 409/12, 409/14, A01N43/36

A4
C4

（以上各欄由本局填註）

576831

發明 新型 專利說明書

一、發明 新型 名稱	中文	三氟甲基吡咯羧醯胺
	英文	TRIFLUOROMETHYLPYRROLCARBOXAMIDES
二、發明 創作 人	姓名	(1)馬汀 艾柏爾 (2)哈若德 華特
	國籍	(1)瑞　士 (2)德　國
	住、居所	(1)瑞士 4103 波特明根,艾斯特哈格街 22 號 (2)瑞士 4118 羅德史多夫,奇梅特街 126 號
三、申請人	姓名（名稱）	諾華公司
	國籍	瑞　士
	住、居所（事務所）	瑞士 4058 巴賽爾城,黑森林大道 215 號
	代表人 姓名	(1)威納.瓦得克 (2)瓦特勞.佛格勒

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

裝 訂 線

（由本局填寫）

承辦人代碼：	
大　　類：	
ＩＰＣ分類：	

A6
B6

本案已向：

英　　國（地區）　申請專利，申請日期 1998.08.12 案號 9817548.2，□有　☑無主張優先權

有關微生物已寄存於：　　，寄存日期：　　，寄存號碼：

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄）

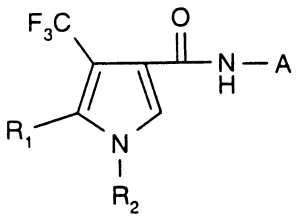
裝　訂　線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明（ | ）

本發明關於一種新穎的三氟甲基吡咯羧醯胺，其具有殺微生物活性，尤其是殺真菌活性。本發明亦關於這些物質的製備，關於農業化學組成物(其含有至少一種該新穎化合物當作有效成分)，關於上述組成物的製備，及使用該有效成分或組成物於農業和園藝以便控制或防止植物被植物致病性微生物(較佳爲真菌)所感染。

本發明的三氟甲基吡咯羧醯胺具有通式 I



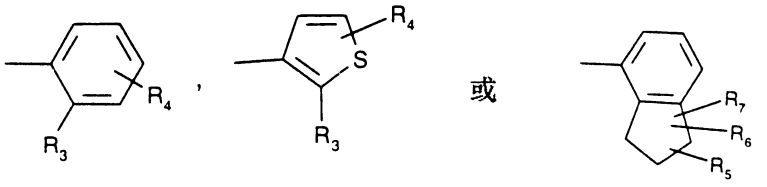
(I)

其中

R_1 係氫、鹵素、C_{1-4} 鹵烷基或 C_{1-4} 烷基，

R_2 係 C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 鹵烷基、C_{1-4} 烷氧基-C_{1-4} 烷基、氰基、C_{1-4} 烷磺醯基、苯磺醯基、二(C_{1-4} 烷基)胺磺醯基、C_{1-6} 烷羰基、苯醯基或經取代的苯磺醯基或苯醯基，及

A 係基



或

其中

R_3 係 C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 鹵烷基、C_{2-6} 烯基、C_{2-6} 鹵烯基、

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線

五、發明說明（ㄚ）

C_{2-6} 炔基、C_{1-6} 烷氧基、C_{1-6} 鹵烷氧基、C_{2-6} 烯氧基、C_{2-6} 鹵烯氧基、C_{2-6} 炔氧基、C_{3-7} 環烷基、C_{1-4} 烷基-C_{3-7} 環烷基、C_{4-7} 環烯基、C_{1-4} 烷基-C_{4-7} 環烯基、C_{3-7} 環烷氧基、C_{1-4} 烷基-C_{3-7} 環烷氧基、C_{5-7} 環烯氧基、C_{1-4} 烷基-C_{5-7} 環烯氧基、苯基、萘基、苯氧基、萘氧基或經取代的苯基或苯氧基，其中取代基係一至三個獨立選自於鹵素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 烷硫基、氰基、C_{1-4} 烷氧羰基、C_{1-4} 烷羰基、C_{1-4} 鹵烷基、C_{1-4} 鹵烷氧基、亞甲基二氧基或二氟亞甲基二氧基、或苯基的基；

R_4 係氫、鹵素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 鹵烷基、C_{1-4} 烷氧基或 C_{1-4} 鹵烷氧基；及

R_5、R_6 與 R_7 互相獨立地係 C_{1-6} 烷基、C_{3-7} 環烷基或 C_{3-7} 環烷基-C_{1-4} 烷基。

由 EP-A-0545099 知道可用於農業實務的具有殺真菌活性之煙酸醯胺。所揭示用於實際用途的化合物並非經常滿足現代農業需求。

令人驚異地，現已經發現式 I 化合物表現改良的生物特性，其使得它們更適合於農業和園藝的實際用途。

當不對稱碳原子出現於式 I 化合物中時，這些化合物係爲光學活性形式。本發明關於純異構物，如鏡像異構物及非鏡像異構物，以及所有可能的異構物混合物，例如非鏡像異構物、消旋物或消旋物之混合物。

在本發明說明書內，烷基表示甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、第二丁基、異丁基、第三丁基、正戊基

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

五、發明說明（7）

、異戊基、第二戊基、第三戊基及新戊基。較佳爲不含支鏈的烷基。以類及的方式使烷基當作其它基如烷氧基、烷硫基、鹵烷基、烷基環烷基、烷基環烷氧基、烷羰基、烷磺醯基、烷胺基等的部分係可了解的。將了解的是鹵素通常意味氟、氯、溴或碘。氟、氯或溴係爲較佳的定義。以類似的方式使鹵素當作其它基如鹵烷基、鹵烷氧基、鹵烯基、鹵烯氧基或鹵苯基等的部分係可了解的。經取代的苯磺醯基或苯醯基之取代基可能出現一至五次且較佳係獨立地選自於鹵素、C_{1-4}烷基、C_{1-4}烷氧基、C_{1-4}烷硫基、氰基、C_{1-4}烷氧羰基、C_{1-4}烷羰基、C_{1-4}鹵烷基、C_{1-4}鹵烷氧基、亞甲基二氧基或二氟亞甲基二質基、或苯基。當作爲苯基、苯磺醯基、苯氧基及苯醯基之部分的苯基係經取代時，則該基例如是 2-氯苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、2-氟苯基、3-氟苯基、4-氟苯基、2,4-二氯苯基、3,4-二氯苯基、3,5-二氯苯基、2,4-二氟苯基、3,4-二氟苯基、3,5-二氟苯基、2-三氟甲基苯基、3-三氟甲基苯基、4-三氟甲基苯基、2-三氟甲氧基苯基、3-三氟甲氧基苯基、4-三氟甲氧基苯基、4-甲基苯基、4-乙基苯基、4-異丙基苯基-4-第三丁基苯基、3,4-二甲基苯基、2,4,6-三甲基苯基、3-氯-4-氟苯基、4-氯-3-氟苯基、4-聯苯基、3-聯苯基等等。

有效成分的一特殊子群係由式 I 化合物所代表，其中R_1係氫或C_{1-4}烷基，

R_2係C_{1-4}烷基，及

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

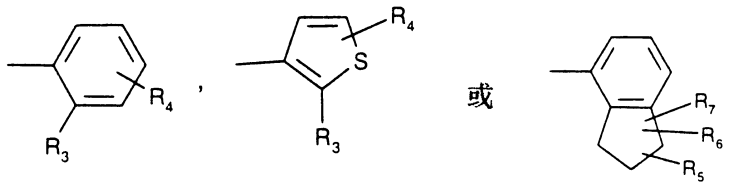
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

五、發明說明（4）

A 係基



或

其中

R_3 係 C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 鹵烷基、C_{2-6} 烯基、C_{2-6} 鹵烯基、C_{2-6} 炔基、C_{1-6} 烷氧基、C_{1-6} 鹵烷氧基、C_{2-6} 烯氧基、C_{2-6} 鹵烯氧基、C_{2-6} 炔氧基、C_{3-7} 環烷基、C_{1-4} 烷基-C_{3-7} 環烷基、C_{4-7} 環烯基、C_{1-4} 烷基-C_{4-7} 環烯基、C_{3-7} 環烷氧基、C_{1-4} 烷基-C_{3-7} 環烷氧基、C_{5-7} 環烯氧基、C_{1-4} 烷基-C_{5-7} 環烯氧基、苯基、萘基、經一至三個獨立選自於鹵素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 烷硫基、氰基、C_{1-4} 烷氧羰基、C_{1-4} 烷羰基、C_{1-4} 鹵烷基、C_{1-4} 鹵烷氧基、亞甲基二氧基或二氟亞基基二氧基、或苯基取代的苯基；

R_4 係氫、鹵素或 C_{1-4} 烷基；及

R_5、R_6 與 R_7 互相獨立地係 C_{1-6} 烷基、C_{3-7} 環烷基或 C_{3-7} 環烷基-C_{1-4} 烷基。

式 I 化合物中，較佳的基爲：

a) R_1 係氫或甲基，或

b) R_2 係甲基，或

c) R_3 係苯基或經鹵素取代的苯基。

另一較佳的子群係由式 I 化合物所構成，其中 R_1 係氫或甲基，R_2 係甲基，且 R_3 係苯基或經鹵素取代的苯基。

較佳的個別化合物係：

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（ 5 ）

N-(2-聯苯基)-1-甲基-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺，

N-(4'-氯-2-聯苯基)-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺，

N-(4'-氟-2-聯苯基)-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺，

N-[2-(4-氟苯基)-3-噻吩基)-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺，

N-[2-(4-氯苯基)-3-噻吩基)-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺，

N-(3'4'-二氟-2-聯苯基)-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺，

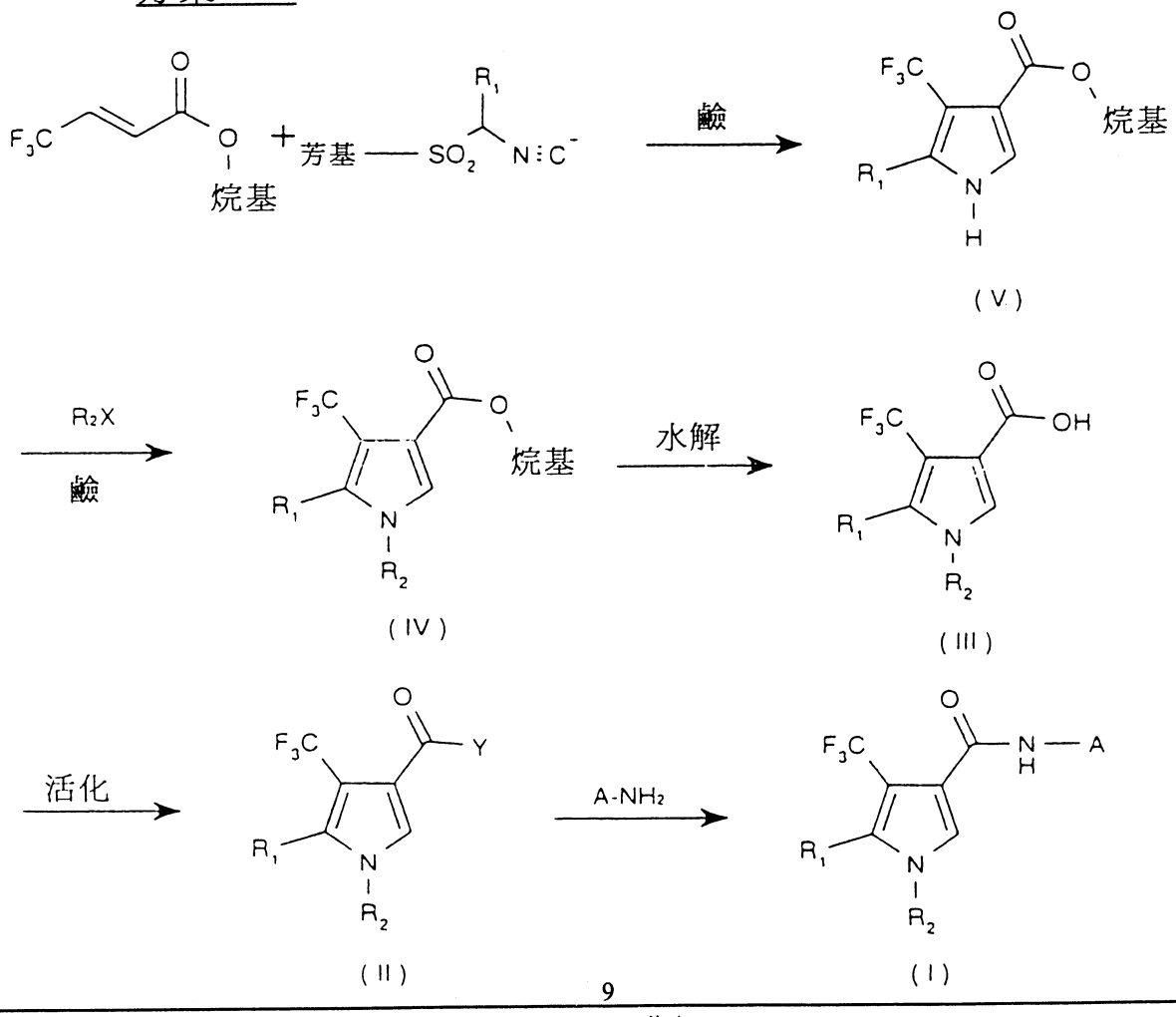
N-(3'-三氟甲基-2-聯苯基)-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺，

及

N-(4'-氯-3'-三氟-2-聯苯基)-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺。

可依照以下反應方案來製備式 I 化合物

方案 1：



本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

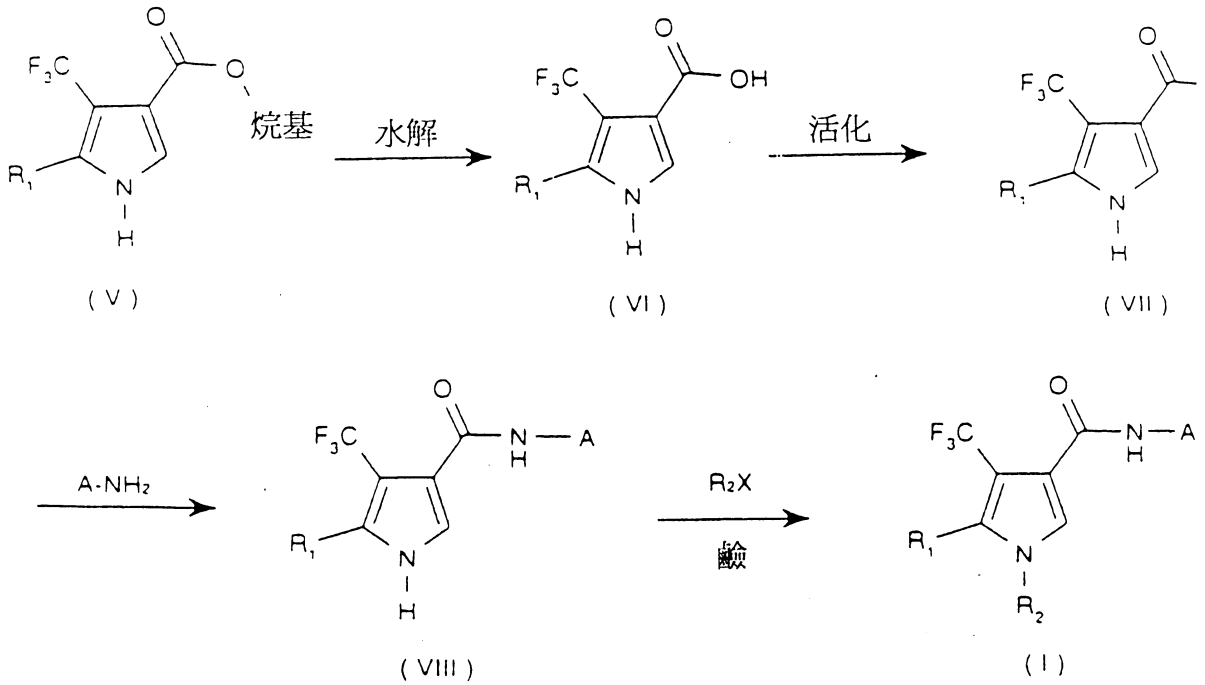
五、發明說明（ 6 ）

其中 A、R_1 和 R_2 係如式 I 中所定義，X 和 Y 係脫離基，烷基指低級烷基部分，而芳基代表苯基或甲苯基。

脫離基 X 和 Y 較佳指鹵素原子，但是亦可代表混合酐之部分，例如-O-CO-烷基、-O-PO(烷基)$_2$、-O-C(=N-烷基)、三唑基等等。

另可選擇地，根據方案 2，基 R_2 和 A 的導入係可爲不同順序。

方案 2：



(V) (VI) (VII) (VIII) (I)

其中 A、R_1、R_2、X 和 Y 係如式 I 中所定義。

在特殊的取代樣式中，可有利地利用在吡咯環第一位置的保護基，俾避免在第三位置的羰官能之醯胺化反應期間發生副反應。適合的保護基係苄基等。亦可藉普通的苄化作用和水解反應來導入或斷裂保護基。

較佳藉使活化的式 II 羧酸與芳胺反應而獲得新式 I 羧

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

五、發明說明（ 7 ）

胺。視脫離基 Y 而定，於酸結合劑的存在下來進行反應。較佳使用惰性溶劑，但是亦可使用含水的溶劑混合物，稱作 Schotten-Baumann 條件。

藉使吡咯羧酸 III 與活化劑如醯鹵(例如亞硫醯氯或草醯氯)反應以產生對應的醯氯(Y=氯)或藉文獻中所知的其它一般偶合活化方法來達成活化。

使用標準的水解條件，藉水解由對應的酯類可製備式 III 的羧酸。

使用於標準的條件，使式 V 的吡咯羧酸酯與烷化劑如二烷基硫酸鹽、鹵烷或烷基磺酸鹽反應可達成式 V 吡咯羧酸的 N-烷化而產生式 IV 的 N-烷化吡咯羧酸酯。可依照 van Leusen 模式，即在鹼的存在下，使丙烯酸烷酯與芳基磺醯基異氰化物反應而典型地製備式 V 的吡咯羧酸酯。方案 1 中所採用的典型鹼包括金屬氫化物、金屬醇鹽及金屬氫氧化物。可使用在反應條件下爲惰性的任一種溶劑。代表性的溶劑包括醚類(乙醚、二甲氧乙烷、THF 等等)，極性非質子溶劑，如 DMSO、DMF、DMA，或極性溶劑，如醇類。亦可使用該溶劑的混合物。在許多情況中，可以使用相轉移反應條件，其自然地需要兩相反應系統。較佳爲將方案 I 的整個反應序列當作單-容器-反應來進行。

令人驚異地，現已發現新穎的式 I 化合物在實用上具有非常有利的活性範圍，用於保護植物防止真菌、細菌及病毒所引的疾病。

式 I 化合物口用於農業部門和相關領域當作控制植物

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（8）

害蟲用的活性成分。新穎化合物之特色在於低施用比率時的極佳活性，植物能良好忍受及環境上安全的。它們具有非常有效的治病性、預防性及內吸性，且用於保護許多栽培的植物。式 I 化合物可用於抑制或破壞發生在植物或植物局部(果實、花、葉、莖、塊莖、根)的害蟲，同時亦保護成長緩慢的植物部分，例如防止植物致病性微生物。

亦可以使用式 I 化合物當作施肥劑用於處理植物繁殖材料，特別是種子(果實、塊莖、穀粒)及植物插枝(例如稻米)，以便保護防止真菌感染以及防止發生在土壤中的植物致病真菌。

化合物 I 例如可有效對抗以下綱的植物致病真菌：半知菌綱(例如例如葡萄孢屬(Botrytis)、芽粉孢屬(Pyricularia)、長蠕孢屬(Helminthosporium)、鐮孢屬(Fusarium)、殼針孢屬(Septoria)、尾孢屬(Cercospora)和鏈格孢屬(Alternaria))及擔子菌綱(例如絲核菌綱(Rhizoctonia)、駝孢銹菌屬(Hemileia)、柄銹菌屬(Puccinia))。此外，它們係有效於對抗子囊菌綱(例如黑星菌屬(Venturia)和白粉菌屬(Erysiphe)、柄杯菌屬(Podosphaera)、鏈核盤菌屬(Monilinia)、鉤絲殼屬(Uncinula))及卵菌綱(例如腫梗霉屬(phytophthora)、腐霉屬(Pythium)、單軸霉屬(Plasmopara))。再者，新穎的式 I 化合物亦有效於對抗植物致病細菌及病毒(例如，黃單膜菌屬 spp、假單胞菌屬 spp、Erwinia amylovora 以及煙草花葉病毒)。

本發明範圍內所欲保護的目標農作物例如包括以下種

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（9）

植物：穀類(小麥、大麥、黑麥、燕麥、稻米、玉米、高粱及相關的物種)；甜菜(糖用甜菜及飼用甜菜)；仁果、梨果、核果及小果(蘋果、梨、李子、桃子、杏仁、櫻桃、草莓、樹莓及黑莓)；豆科植物(豆、小扁豆、碗豆、大豆)；油料植物(油菜、芥菜、罌粟、橄欖、向日葵、椰子、蓖麻、可可豆、花生)；黃瓜植物(葫蘆、黃瓜、甜瓜)；纖維植物(棉花、亞麻、大麻、黃麻)；柑橘類水果(柳橙、檸檬、葡萄柚、橘)；蔬菜(菠菜、萵苣、蘆荀、甘藍菜、葫蘿蔔、洋蔥、番茄、馬鈴薯、辣椒)；樟科(酪梨、肉桂、樟腦)；及植物如菸草、堅果、咖啡、茄子、甘蔗、茶、胡椒、葡萄樹、蛇麻子、香蕉樹及天然橡膠植物，以及觀賞用植物。

式 I 化合物以未改變的形式使用，較宜上連同習用於配方技藝中的佐劑。爲此目的，可以依已知的方式將它們配成可乳化的濃縮物，可塗覆的膏糊，可直接噴灑的或可稀釋的溶液，稀釋的乳化液，可濕性粉末，可溶性粉末，粉塵，顆粒，以及包封在聚合物質內。當爲組成物的形態時，依照所欲的目標及優勢的環境來選擇施用的方法，如噴灑、霧化、撒粉、散播、塗覆或傾到。組成物亦可更含有佐劑，如安定劑、防沫劑、黏度調整劑、黏合劑或膠黏劑以及肥料、微營養料供體或其它用於獲得特殊效果的配方。

適合的載體和佐劑可爲固體或液體，且係爲適合於配方技術的物質，例如天然或再生的礦物質、溶劑、分散劑

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（10）

、潤濕劑、膠黏劑、增稠劑、黏合劑或肥料。該載體例如敘述於 WO 97/33890 中。

通常以組成物的形式使用式 I 化合物，及可施用於要處理的農作物區域或植物，同時或接在其它化合物之後。這些其它化合物例如可爲肥料或微量養份供體或其它影響植物生長的製劑。它們亦爲選擇性的除草劑以及殺蟲劑、殺真菌劑、殺菌劑、殺線蟲劑、殺軟體動物劑或數種這些製劑的混合物，若需要可連同其它習用於此藝的載體、界面活性劑或施用促進佐劑。

式 I 化合物可與其它殺真菌劑混合，在某些情況中產生出乎意料的相乘活性。

特佳的混合成分係唑類，如吖可唑(azaconazole)、必特坦(bitertanol)、伯比可唑(propiconazole)、戴芬可唑(difenoconazoie)、戴尼可唑(diniconazole)、西伯可唑(cyproconazole)、艾波西可唑(epoxiconazole)氟昆可唑(fluquinconazole)、氟西來唑(flusilazole)、氟特利活(flutriafol)、六可唑(hexaconazole)、尹麥拉利(imazalil)、尹米苯可唑(imibenconazole)、依波可唑(ipconazole)、特比可唑(tebuconazole)、四可唑(tetraconazole)、芬比可唑(fenbuconazole)、美他可唑(metconazole)、麥克比坦爾(myclobutanil)、伯夫唑鹽(perfurazoate)、班可唑(penconazoie)、溴目可唑(bromuconazole)、皮里芬克司(pyrifenox)、伯若克拉滋(prochloraz)、特利狄風(triadimefon)、特利狄美羅(triadimenol)、特利氟米唑

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（11）

(triflumizole)或特利提可唑(triticonazole)；嘧啶甲醇類，如安西米醇(ancymidol)、芬那里醇(fenarimol)或奴里醇(nuarimol)；2-胺基嘧啶，如比匹里麥特(bupirimate)、戴美利莫(dimethirimol)或艾利莫(ethirimoi)；嗎啉類，如多晶莫非(dodemorph)、天波匹丁(tenpropidin)、芬白匹莫非(fenpropimorph)、螺克米(spiroxamin)或特利狄莫非(tridemorph)；苯胺嘧啶類，如西伯狄尼(cyprodinil)、匹里美尼(pyrimethanil)或美盤匹里(mepanipyrim)；吡唑類，如芬匹可尼(fenpiclonil)或氟戴可若尼(fludioxonil)；苯基醯胺類(phenylamides)，如苯那來克西(benalaxyl)、氟拉克西(furalaxyl)、美他克西(metaiaxyi)、R-美他克西(R-metalaxyl)、歐佛拉西(ofurace)或歐克戴西(oxadixyl)；苯並咪唑類，如苯若米(benomyi)、卡苯戴里(carbendazim)、得巴卡伯(debacarb)、氟巴里唑(fuberidazole)或噻奔唑(thiabendazole)、二羧醯亞胺類，如克羅里那特(chlozolinate)、戴西若林(dichiozoline)、尹波汀(iprodine)、麥克若林(myclozoline)波若西米酮(procymidone)或比克若林(vinclozolin)；羧醯胺類，如卡伯克西(carboxin)、芬氟蘭(fenfuram)、氟托蘭尼(flutolanil)、曼白尼勒(mepronil)、歐卡伯克西(oxycarboxin)或利非拉醯胺(thifiuzamide)；胍類，如瓜拉汀(guazatine)、朵叮(dodine)或尹米歐克啶(iminoctadine)；史特比尿類，如歐若克司特冰(azoxystrobin)、克羅梭西馬里(kresoximmethyl)、美托米若史特冰(metominostrobin)、SSF-129、甲基2-[(2-三氟甲基)-

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（17）

吡啶-6-基氧基甲基]-3-甲氧基丙烯酸酯或 2-[(α{[(α-甲基-3-氟甲基-苄基)亞胺基]氧基}-鄰甲苯基]-乙醛酸-甲酯-鄰甲肟(trifoxystrobin)；二硫胺甲酸酯類，如法斑(ferbam)、曼可伯(mancozeb)、曼伯(maneb)、曼替蘭(metiram)、波比伯(propineb)、里蘭(thiram)、利伯(zineb)或利蘭(ziram)；N-鹵甲基硫二羧醯亞胺類，如卡白他佛(captafol)、卡巴坦(captan)、二氯氟尼得(dichlofluanid)、氟米得(fluoromide)、活配特(folpet)托利弗尼得(tolyfluanid)；銅化合物，如伯狄烏克(Bordeaux)混合物、氫氧化銅、氧氯化銅、硫酸銅、氧化亞銅、曼銅、8-羥喹啉-銅；硝基酚衍生物，如 8-羥喹啉-銅；硝基酚衍生物，如二若卡伯(dinocap)或硝拉(nitrothal)-異丙基；有機磷衍生物，如艾狄芬活司(edifenphos)、尹伯苯活司(iprobenphos)、異伯硫烷(isoprothioiane)、弗戴芬(phosdiphen)、匹拉活司(pyrazophos)或托克弗司((toclofos)-甲基；及其它各種化合物，如阿起苯來(acibenzolar)-S-甲基、安尼來哄(anilazine)、伯拉司西汀(blasticidin)-S、起若美里那特(chinomethionat)、克若尼伯(chloroneb)、克若太若尼(chlorothalonil)、西莫克尼(cymoxanil)、戴克隆(dichlone)、戴克美哄(diclomezine)、戴克南(dicloran)、戴也若芬卡伯(diethofencarb)、戴美馬弗(dimethomorph)、戴里隆(dithianon)、艾特里戴唑(etridiazole)、法莫克冬(famoxadone)、芬汀(fentin)、發米隆(ferimzone)、弗錄里南(fluazinam)、弗硫醯胺(flusulfamide)、芬害克得米得

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線

五、發明說明（17）

(fenhexdmid)、佛司提(fosetyl)-鋁、海美唑羅(hymexazol)、凱舒美新(kasugamycin)、美沙弗卡伯((methasuifocarb)、潘西科隆(pencycuron)、苯酞(phthalide)、多可西(polyoxins)、伯苯唑(probenazole)、伯潘卡巴(propamocarb)、吡咯喹隆(pyroquilon)、喹氧芬(quinoxyfen)、喹托林(quintozene)、硫、三唑氧化物(triazoxide)、三環唑(tricyclazole)、三弗林(triforine)或巴利的麥西(validamycin)、(S)-5-甲基-2-甲硫基-5-苯基-3-苯基-胺基-3,5-二氫咪唑-4-酮(RPA 407213)、3,5-二氯-N-(3-氯-1-乙基-1-甲基-2-氧丙基)-4-甲基苯醯胺(RH-7281)、N-烯丙基-4,5-二甲基-2-三甲基矽烷基噻吩-3-羧醯胺(MON 65500)、4-氯-4-氰基-N,N-二甲基-5-對甲苯基咪唑-1-磺醯胺(IKF-916)、N-(1-氰基-1,2-二甲基丙基)-2-(2,4-二氯苯氧基)-丙醯胺(AC 382042)或尹泊羅伐利卡伯<iprovalicarb>(SZX 722)。

施用式 I 化合物或含有至少一種該化合物的農業化學組成物之較佳方法係葉子施用。施用的頻率及施用的速率將視對應的病原之感染危險而定。然而，可用液體配方浸濕植物的場所使式 I 化合物經由土壤經由根部滲透入植物內(內吸作用)，或以固狀，例如顆粒形式將化合物施用於土壤(土壤施用)。在水稻農作物中，該顆粒可施用於浸水的稻田中。可將式I化合物施用於種子(包覆)，其係藉由將種子或塊莖浸漬於殺真菌劑的液體配方殿中或用固體配包覆它們。

配方，例如是含有式 I 化合物的組成物，若需要，則

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂 線

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（14）

依已知方式製備固體或液體佐劑，典型上藉緊密混合及/或研磨化合物和擴張劑，例如溶劑、固體載體及視需要選用的界面活性化合物(界面活性劑)。

農業化學配方將通常含有 0.1 至 99 重量%，較佳 0.1 至 95 重量%的式 I 化合物，99.9 至 1 重量%，較佳 99.8 至 5 重量%的固體或液體佐劑，及 0 至 25 重量%，較佳 0.1 至 25 重量%的界面活性劑。

有利上的施用速率通常爲每公頃(ha)有 5 克至 2 公斤的活性成分(a.i.)，較佳 10 克至 1 公斤 a.i./ha，最佳 20 克至 600 克 a.i./ha。當用作爲種子浸泡劑時，方便上的劑量爲每公斤種子使用 10 毫克至 1 克活性物質。

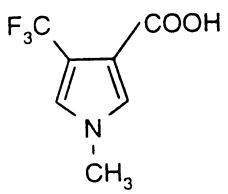
雖然如此，但是較佳爲配成濃縮物形式的商品，最終使用者將通常使用稀釋的配方。

以下非限制性的實例係更詳細說明上述本發明。溫度給予攝氏度。使用以下縮寫：m.p.=熔點；b.p.=沸點。"NMR"意味核磁共振光譜。MS=質譜。"%"係重量百分率，除非在其它單位中有指出對應的濃度。

製備例

實例 P1：N-(2-聯苯基)-1-甲基-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺

a)1-甲基-4-三氟甲基吡咯-3-羧酸



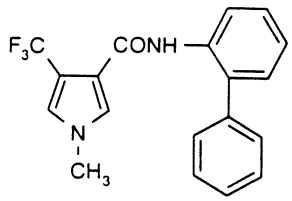
（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（15）

使氫化鈉(8.0 克在油中之 75%懸浮液)懸浮於 5℃的 DMSO(300 毫升)和乙醚(100 毫升)之混合物中。經由滴液漏斗來添加 4,4,4-三氟巴豆酸乙酯(20 克)和 TOSMIC(23 克)/DMSO(100 毫升)之溶液，速率爲不使溫度超過 10℃。於室溫攪拌反應混合物另一小時後，在冷卻中添加碘甲烷(15.6 毫升)。於室溫 2 小時後，將反應混合物倒於碎冰上。用醚重複萃取，用鹽水洗合併的有機相，及於減壓下蒸發溶劑而產生淡琥珀色油狀的產品混合物。在乙醇(100 毫升)和氫氧化鈉(50 毫升的 30%水溶液)中，於 60℃加熱粗產品混合物。用醚來洗溶液，用濃鹽酸來酸化水相，及過濾而產生 1-甲基-4-三氟甲基吡咯-3-羧酸，爲結晶固體形式。

^{1}H-NMR($CDCl_3$)：7.24(d,1H)；6.88(d,1H)；3.63(s,3H)。

b)N-(2-聯苯基)-1-甲基-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺



於室溫在催化量的 DMF 之存在下攪拌 1-甲基-4-三氟甲基吡咯-3-羧酸(1.9 克)和草醯氯(0.9 毫升)/二氯甲烷(20 毫升)之溶液。於減壓下蒸發溶劑而產生一種結晶固體。將此固體溶解於二氯甲烷(10 毫升)中，及於 0℃加到 2-聯苯胺(1.7 克)和三乙胺(4.2 毫升)/二氯甲烷(20 毫升)之溶液中。於室溫攪拌反應混合物 2 小時。於減壓下蒸發溶劑，添

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線

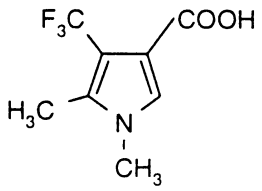
五、發明說明（6）

加水及過濾而獲得 N-(2-聯苯基)-1-甲基-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺。

^{1}H-NMR($CDCl_3$)：8.37(d,1H)；7.60(s,br,1H)；7.48-7.14(m,8H)；7.03(d,1H)；6.88(d,1H)；3.63(s,3H)。

實例 P2：N-(2-聯苯基)-1,5-二甲基-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺

a)1,5-二甲基-4-三氟甲基吡咯-3-羧酸



於 5℃攪拌 TOSMIC(20 克)、碘甲烷(18.5 克)及 N-苄基三乙銨氯化物(1 克)/二氯甲烷(100 毫升)和氫氧化鈉水溶液(30 毫升的 50%溶液)的混合物歷 3 小時。經由滴液漏斗來添加 4,4,4-三氟巴豆酸乙酯(20 克)/二氯甲烷(50 毫升)之溶液，速率爲不使溫度超過 25℃。於室溫攪拌反應混合物另一小時後，在冷卻中添加過量的碘甲烷。於室溫 2 小時後，將反應混合物倒於碎冰上。用醚重複萃取，用鹽水洗合併的有機相，及蒸發溶劑而獲得粗產品混合物。在矽膠上層析後獲得純中間物。於實例 1a)所述的條件下完成水解，而獲得 1,5-二甲基-4-三氟甲基吡咯-3-羧酸，爲無色結晶固體。

^{1}H-NMR(d_6-DMSO)：12.04(s,br,1H)；7.50(s,1H)；3.58(s,3H)；2.27(s,3H)。

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

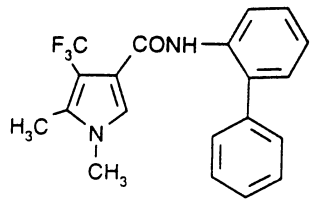
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝 訂

五、發明說明（17）

b)N-(2-聯苯基)-1,5-二甲基-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺



於室溫在催化量的 DMF 之存在下攪拌 1,5-二甲基-4-三氟甲基吡咯-3-羧酸(1.9 克)和草醯氯(0.9 毫升)/二氯甲烷(20 毫升)之溶液。於減壓下蒸發溶劑而產生一種結晶固體。將此固體溶解於二氯甲烷(10 毫升)中，及於 0℃加到 2-聯苯胺(1.7 克)和三乙胺(4.2 毫升)/二氯甲烷(20 毫升)之溶液中。於室溫攪拌反應混合物 2 小時。於減壓下蒸發溶劑，添加水及過濾而獲得 N-(2-聯苯基)-1,5-二甲基-4-三氟甲基吡咯-3-醯胺。

^{1}H-NMR($CDCl_3$)：8.39(d,1H)；7.58(s,br,1H)；7.48-7.14(m,9H)；3.58(s,3H)；2.27(s,3H)。

以類似方式使用同樣的方法來製備以下化合物。

表 1：式 I 化合物，其中 R_1 係氫，R_2 係甲基且 A 對應表 A 中的一行。

表 2：式 I 化合物，其中 R_1 和 R_2 係甲基且 A 對應表 A 中的一行。

表 3：式 I 化合物，其中 R_1 係氫，R_2 係乙基且 A 對應表 A 中的一行。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（18）

表 4：式 I 化合物，其中 R_1 係氫，R_2 係甲氧甲基且 A 對應表 A 中的一行。

表 5：式 I 化合物，其中 R_1 係氫，R_2 係氰基且 A 對應表 A 中的一行。

表 6：式 I 化合物，其中 R_1 係氫，R_2 係甲磺醯基且 A 對應表 A 中的一行。

表 7：式 I 化合物，其中 R_1 係氫，R_2 係苯磺醯基且 A 對應表 A 中的一行。

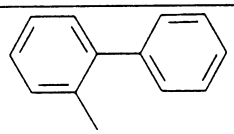
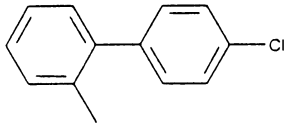
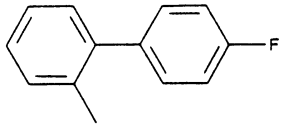
表 8：式 I 化合物，其中 R_1 係氫，R_2 係乙醯基且 A 對應表 A 中的一行。

表 9：式 I 化合物，其中 R_1 係氫，R_2 係甲氧乙醯基且 A 對應表 A 中的一行。

表 10：式 I 化合物，其中 R_1 係氫，R_2 係苯醯基且 A 對應表 A 中的一行。

表 11：式 I 化合物，其中 R_1 係氫，R_2 係 4-氟苯醯基且 A 對應表 A 中的一行。

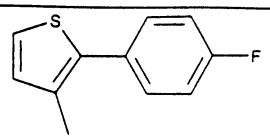
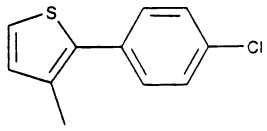
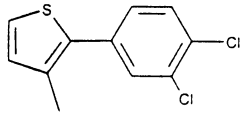
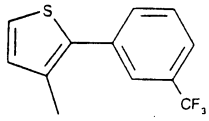
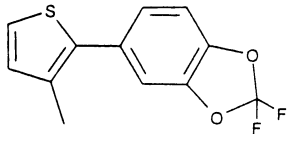
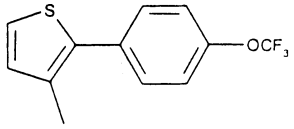
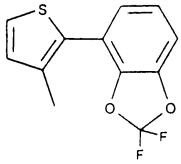
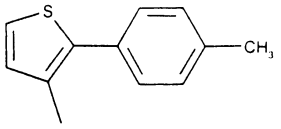
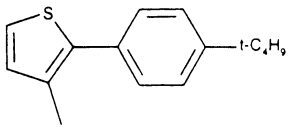
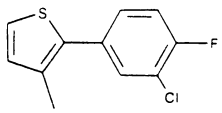
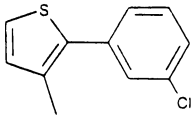
表 A：

化合物號數	A
01	
02	
03	

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

A7
B7

五、發明說明（19）

04	
05	
06	
07	
08	
09	
10	
11	
12	
13	
14	

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

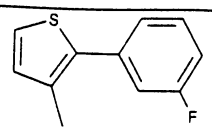
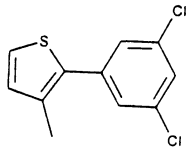
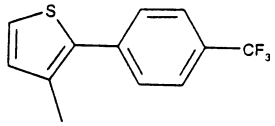
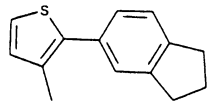
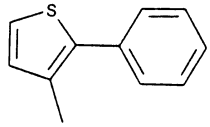
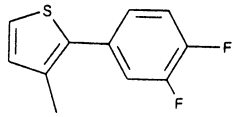
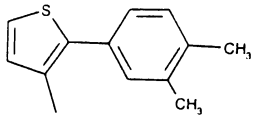
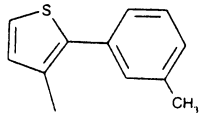
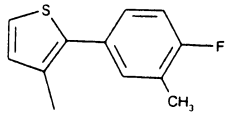
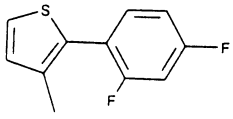
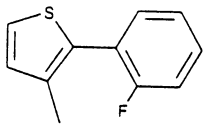
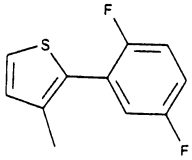
裝 訂

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

A7
B7

五、發明說明（ 2 ）

15	
16	
17	
18	
19	
20	
21	
22	
23	
24	
25	
26	

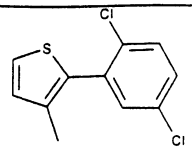
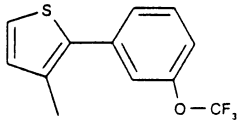
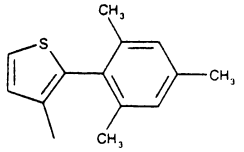
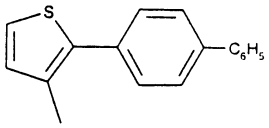
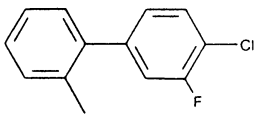
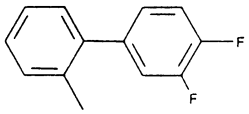
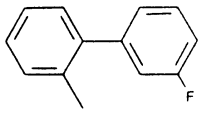
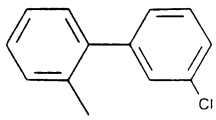
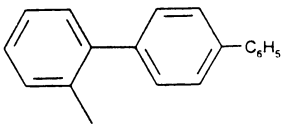
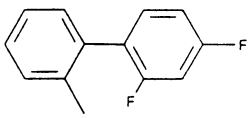
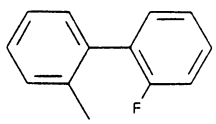
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線

A7
B7

五、發明說明（>/）

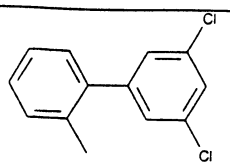
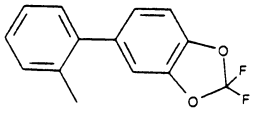
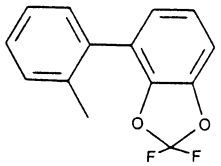
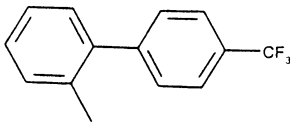
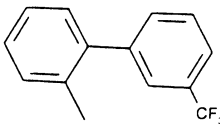
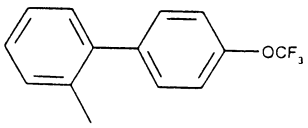
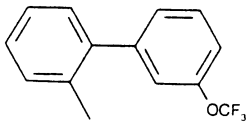
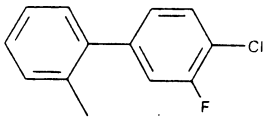
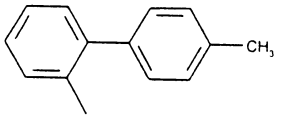
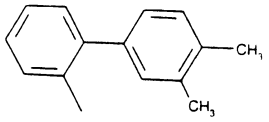
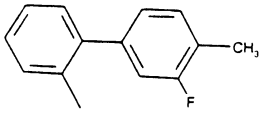
27	
28	
29	
30	
31	
32	
33	
34	
35	
36	
37	

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂

A7
B7

五、發明說明（77）

38	
39	
40	
41	
42	
43	
44	
45	
46	
47	
48	

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

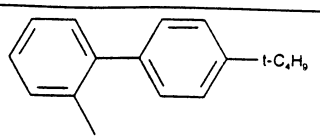
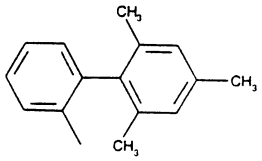
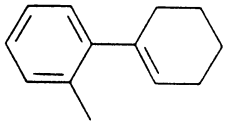
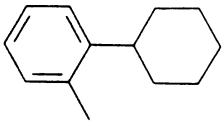
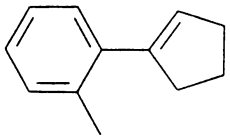
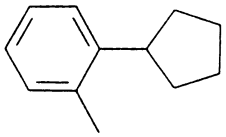
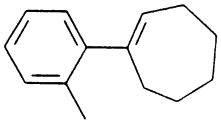
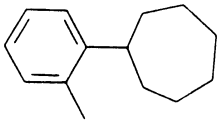
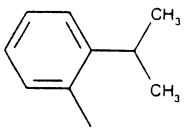
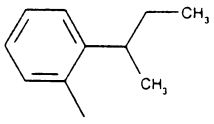
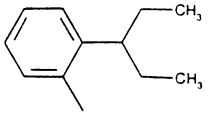
訂

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

A7
B7

五、發明說明（ㄨㄋ）

49	
50	
51	
52	
53	
54	
55	
56	
57	
58	
59	

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

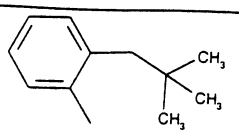
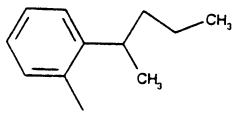
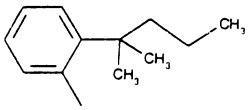
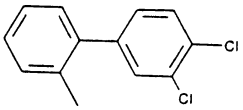
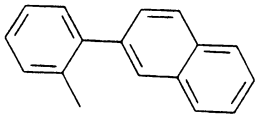
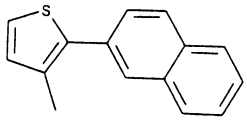
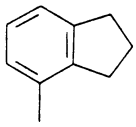
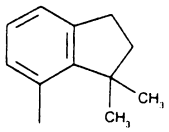
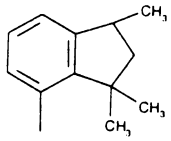
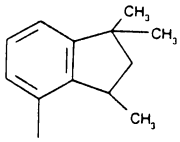
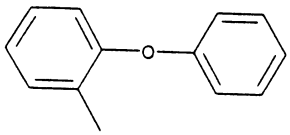
訂

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

A7
B7

五、發明說明（24）

60	
61	
62	
63	
64	
65	
66	
67	
68	
69	
70	

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（21）

式 I 化合物的配方例

WO 97/33890 中敘述用於製備式 I 化合物之配方的工作程序，如可乳化性濃縮物、溶液、顆粒、粉塵及可濕性粉末。

生物例：殺真菌作用

實例 B-1：抗小麥葉銹病菌(小麥葉銹病)的作用

在噴霧室內用配成的試驗化合物(0.02%有效成分)來處理一星期大的小麥植物 cv. Arina。在施用後一天，將孢子懸浮液(1×10^5 夏孢子/毫升)噴灑於試驗植物上以接種小麥植物。於 20℃和 95%相對濕度培育 2 天後，將植物保持於 20℃和 60%相對濕度的溫室中 8 天。在接種後 10 天，評估發病率。

表 1 至 11 的化合物在這些試驗中表現良好的活性(<20%感染)。

實例 B-2：抗蘋果白粉病菌(蘋果白粉病)的作用

在噴霧室內用配成的試驗化合物(0.002%有效成分)來處理五星期大的蘋果苗木 cv. Mclntosh。在施用後一天，使試驗植物與上述蘋果白粉病菌一起搖動以接種蘋果植物。於 14/10h(光亮/黑暗)之光制度下將植物保持於 22℃和 60%相對濕度培育 12 天後，評估發病率。

表 1 至 11 的化合物在此試驗中表現良好的活性。化合物 1.01、1.02、1.03、1.04、1.05、1.30、1.35、1.38、1.39

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（>8）

、1.40、1.42、1.71、1.72、1.76、2.02、2.03、2.05、2.35、2.71、3.01、3.02、3.03、3.71、4.02、4.03、4.71、5.02、5.03、5.71、8.02、8.03、8.04 及 8.71 表現強的效力(<20%感染)。

實例 B-3：抗蘋果黑星病菌(蘋果黑星病)的作用

在噴霧室內用配成的試驗化合物(0.02%有效成分)來處理四星期大的蘋果苗木 cv. Mclntosh。在施用後一天，將孢子懸浮液(4×10^5 分生孢子/毫升)噴灑於試驗植物上以接種蘋果植物。於 21℃和 95%相對濕度培育 4 天後，將植物置於 21℃和 60%相對濕度的溫室中 4 天。在 21℃和 95%相對濕度另培育 4 天後，評估發病率。

表 1 至 11 的化合物在這些試驗中表現良好的活性。化合物 1.01、1.02、1.03、1.04、1.05、1.30、1.35、1.38、1.39、1.40、1.42、1.71、1.72、1.76、2.02、2.03、2.05、2.35、2.71、3.01、3.02、3.03、3.71、4.02、4.03、4.71、5.02、5.03、5.71、8.02、8.03、8.04 及 8.71 表現強的效力(<20%感染)。

實例 B-4：抗大麥白粉病菌(大麥白粉病)的作用

在噴霧室內用配成的試驗化合物(0.02%有效成分)來處理一星期大的大麥植物 cv. Express。在施用後一天，使試驗植物與上述大麥白粉病菌一起搖動以接種大麥植物。在 20℃/18℃(白天/夜晚)和 60%相對濕度的溫室中培育 6 天後

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（19）

，評估發病率。

表 1 至 11 的化合物在此試驗中表現良好的活性。化合物 1.01、1.02、1.03、1.04、1.05、1.30、1.35、1.38、1.39、1.40、1.42、1.71、1.72、1.76、2.02、2.03、2.05、2.35、2.71、3.01、3.02、3.03、3.71、4.02、4.03、4.71、5.02、5.03、5.71、8.02、8.03、8.04 及 8.71 表現強的效力(<20%感染)。

實例 B-5：抗蘋果灰黴葡萄孢子(蘋果灰黴葡萄孢子)的作用

在蘋果果實 cv. Golden Delicious3 內鑽三個孔，且各孔裝滿 30 微升所配成的試驗化合物(0.002%有效成分)之滴液。在施用後兩小時，將 50 微升的灰黴葡萄孢子懸浮液(4×10^5 分生孢子/毫升)吸移到應用部位上。於生長室內在 22℃培育 7 天後，評估發病率。

表 1 至 11 的化合物在此試驗中表現良好的活性。化合物 1.01、1.02、1.03、1.04、1.05、1.30、1.35、1.38、1.39、1.40、1.42、1.71、1.72、1.76、2.02、2.03、2.05、2.35、2.71、3.01、3.02、3.03、3.71、4.02、4.03、4.71、5.02、5.03、5.71、8.02、8.03、8.04 及 8.71 表現非常強的效力(<10%感染)。

實例 B-6：抗葡萄灰黴葡萄孢子(葡萄灰黴葡萄孢子)的作用

在噴霧室內用配成的試驗化合物(0.002%有效成分)來處理五星期大的葡萄苗木 cv. Gutedel。在施用後二天，將

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（7）

孢子懸浮液(1×10^6 分生孢子/毫升)噴灑於試驗植物上以接種葡萄植物。於 21℃和 95%相對濕度的溫室中培育 4 天後，評估發病率。

表 1 至 11 的化合物在此試驗中表現良好的活性。化合物 1.01、1.02、1.03、1.04、1.05、1.30、1.35、1.38、1.39、1.40、1.42、1.71、1.72、1.76、2.02、2.03、2.05、2.35、2.71、3.01、3.02、3.03、3.71、4.02、4.03、4.71、5.02、5.03、5.71、8.02、8.03、8.04 及 8.71 表現非常強的效力(<10%感染)。

實例 B-7：抗番茄灰黴葡萄孢子(番茄灰黴葡萄孢子)的作用

在噴霧室內用配成的試驗化合物(0.002%有效成分)來處理四星期大的番茄植物 cv. Roter Gnom。在施用後二天，將孢子懸浮液(1×10^5 分生孢子/毫升)噴灑於試驗植物上以接種番茄植物。於 20℃和 95%相對濕度的生長室中培育 4 天後，評估發病率。

表 1 至 11 的化合物在此試驗中表現良好的活性。化合物 1.01、1.02、1.03、1.04、1.05、1.30、1.35、1.38、1.39、1.40、1.42、1.71、1.72、1.76、2.02、2.03、2.05、2.35、2.71、3.01、3.02、3.03、3.71、4.02、4.03、4.71、5.02、5.03、5.71、8.02、8.03、8.04 及 8.71 表現非常強的效力(<10%感染)。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（21）

實例 B-8：抗大麥網斑病菌(大麥網斑病)的作用

在噴霧室內用配成的試驗化合物(0.002%有效成分)來處理一星期大的大麥植物 cv. Express。在施用後二天，將孢子懸浮液(3×10^4 分生孢子/毫升)噴灑於試驗植物上以接種大麥植物。於 20℃和 95%相對濕度中培育 2 天後，使植物保持於 20℃和 60 相對濕度的溫室中 2 天。在接種後 4 天，評估發病率。

表 1 至 11 的化合物在此試驗中表現良好的活性。化合物 1.01、1.02、1.03、1.04、1.05、1.30、1.35、1.38、1.39、1.40、1.42、1.71、1.72、1.76、2.02、2.03、2.05、2.35、2.71、3.01、3.02、3.03、3.71、4.02、4.03、4.71、5.02、5.03、5.71、8.02、8.03、8.04 及 8.71 表現強的效力(<20%感染)。

實例 B-9：抗小麥穎枯病菌(小麥穎枯病菌)的作用

在噴霧室內用配成的試驗化合物(0.02%有效成分)來處理一星期大的小麥植物 cv. Arina。在施用後一天，將孢子懸浮液(5×10^5 分生孢子/毫升)噴灑於試驗植物上以接種小麥植物。於 20℃和 95%相對濕度中培育 1 天後，使植物保持於 20℃和 60 相對濕度的溫室中 10 天。在接種後 11 天，評估發病率。

表 1 至 11 的化合物在此試驗中表現良好的活性。化合物 1.01、1.02、1.03、1.04、1.05、1.30、1.35、1.38、1.39、1.40、1.42、1.71、1.72、1.76、2.02、2.03、2.05、2.35

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

五、發明說明（）

、2.71、3.01、3.02、3.03、3.71、4.02、4.03、4.71、5.02、5.03、5.71、8.02、8.03、8.04 及 8.71 表現強的效力(<20%感染)。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

A7
B7

89年11月18日 修正補充

五、發明說明（77）

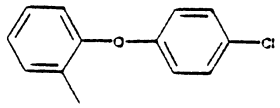
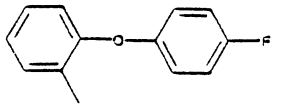
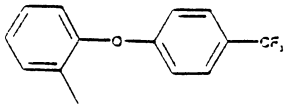
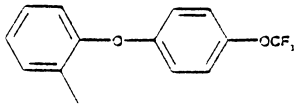
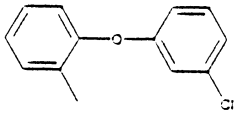
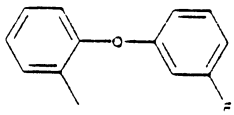
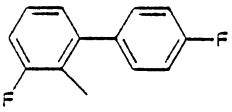
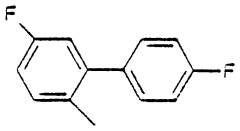
71	
72	
73	
74	
75	
76	
77	
78	

表12　上表1至11之選擇的化合物之物理化學數據

化合物號數	物理化學數據 m.p.[°C] or ^{1}H- NMR ($CDCl_3$)
1.01	8.37(d,1H); 7.60(s,br,1H); 7.48-7.14(m,8H); 7.03(s,1H); 6.88(s,1H); 3.63 (s,3H); m.p. 100-102.
1.02	8.27(d,1H); 7.50(s,br,1H); 7.46-7.18(m,7H); 7.10(d,1H); 6.88(s,1H); 3.63(s,3H).
1.03	8.30(d,1H); 7.52(s,br,1H); 7.44-7.12(m,8H); 6.88(s,1H); 3.63(s,3H); m.p. 151-153.

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂 線

修正
99.11.16 補充

五、發明說明（九）

1.04	7.85(d,1H); 7.74(s,br,1H); 7.44(dd, 2H); 7.30(s,1H); 7.28(s,1H); 7.13(dd,2H); 6.93(s,1H); 3.68(s,3H); m.p. 127-129.
1.05	7.84(d,1H); 7.74(s,br,1H); 7.49(s,4H); 7.30(d,1H); 7.28(d,1H); 6.96(d,1H); 3.68(s,3H; m.p. 142-145.
1.30	7.89(d,1H); 7.76-7.25(m,12H); 6.95(s,1H); 3.69(s,3H); m.p. 168-169.
1.35	m.p. 160-161.
1.38	8.25(d,1H); 7.50(s,br,1H); 7.45-7.08(m,7H); 6.68(s,1H); 3.65(s,3H); 樹脂
1.40	m.p. 122-123.
1.42	m.p. 142-143.
1.71	m.p. 63-65.
1.72	m.p. 112-114.
1.76	樹脂
1.77	m.p. 180-182
1.78	m.p. 166-168
2.02	m.p. 163-165.
2.03	樹脂
2.05	樹脂
2.35	m.p. 124-125.
2.71	樹脂
3.01	樹脂
3.02	樹脂
3.03	樹脂
3.71	樹脂
4.02	樹脂
4.03	樹脂
4.71	樹脂
5.02	樹脂
5.03	樹脂
5.71	樹脂
8.02	樹脂
8.03	樹脂
8.04	樹脂
8.05	樹脂
8.71	樹脂

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝 訂 線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

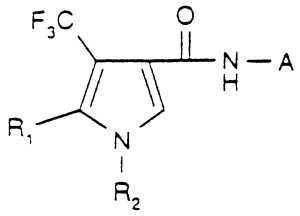
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS)A4 規格（210 × 297 公釐）

A5
B5
修正
年 月 日
89. 11. 18
補充

四、中文發明摘要（發明之名稱：　　）

三氟甲基吡咯羧醯胺

本發明關於一新穎的除害式 I 之三氟甲基吡咯羧醯胺



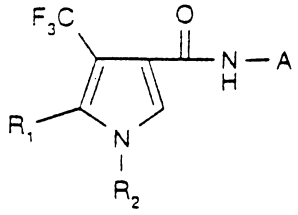
(I)

其中

英文發明摘要（發明之名稱：　　）

TRIFLUOROMETHYLPYRROLCARBOXAMIDES

The invention relates to novel pesticidal trifluoromethylpyrrolcarboxamides of formula I



(I)

wherein R_1 is hydrogen or C_{1-4}alkyl,

R_2 is C_{1-4}alkyl, C_{1-4}alkoxy-C_{1-4}alkyl, cyano or C_{1-6}alkylcarbonyl, and

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄）

裝

訂

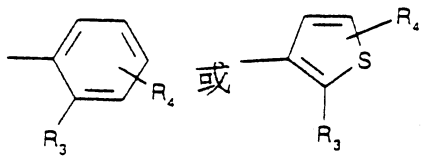
A5
B5
修正
89.11.18

四、中文發明摘要（發明之名稱：　　）

R_1 係爲氫或 C_{1-4} 烷基，

R_2 係爲 C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基-C_{1-4} 烷基、氰基或 C_{1-6} 烷羰基，及

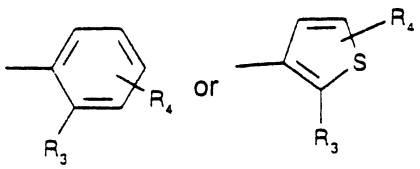
A 係基



其中

英文發明摘要（發明之名稱：　　）

A is a group



wherein

R_3 is phenyl, phenoxy or substituted phenyl or phenoxy wherein the substitutents are one to three groups independently selected from halogen, C_{1-4}haloalkyl, difluoromethylenedioxy or phenyl; and

R_4 is hydrogen or halogen.

The novel compounds have plant-protecting properties and are suitable for protecting plants against infestation by phytopathogenic fungi.

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製
（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄）
裝
訂
線

A5
B5

四、中文發明摘要（發明之名稱：　　）

R_3 係爲苯基、苯氧基或經取代的苯基或苯氧基，其中取代基係一至三個獨立選自於鹵素、C_{1-4} 鹵烷基、二氟亞甲基二氧基或苯基的基；及

R_4 係爲氫或鹵素。

此新穎化合物具有植物保護特性且適用於保護植物防止被植物致病性真菌所感染。

英文發明摘要（發明之名稱：　　）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄）
裝
訂
線
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

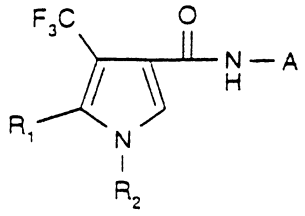
公告本

A8
B8
C8
D8

修正補充

六、申請專利範圍

1.一種式 I 之三氟甲基吡咯羧醯胺，



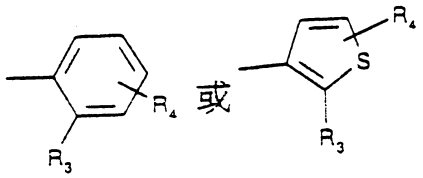
(I)

其中

R_1 係爲氫或 C_{1-4} 烷基，

R_2 係爲 C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基-C_{1-4} 烷基、氰基或 C_{1-6} 烷羰基，及

A 係基



其中

R_3 係爲苯基、苯氧基或經取代的苯基或苯氧基，其中取代基係一至三個獨立選自於鹵素、C_{1-4} 鹵烷基、二氟亞甲基二氧基或苯基的基；及

R_4 係爲氫或鹵素。

2.如申請專利範圍第 1 項之式 I 之三氟甲基吡咯羧醯胺，其中

R_1 係爲氫或 C_{1-4} 烷基，

R_2 係爲 C_{1-4} 烷基，及

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

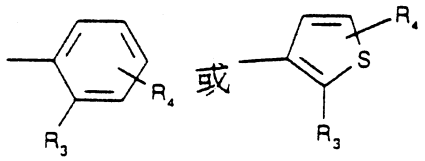
本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線

A8
B8
C8
D8

修正補充

六、申請專利範圍

A 係基  或

其中

R_3 係爲苯基、經一至三個獨立選自於鹵素、C_{1-4} 鹵烷基、二氟亞甲基二氧基或苯基取代的苯基；及

R_4 係爲氫或鹵素。

3.如申請專利範圍第 1 或 2 項之式 I 之三氟甲基吡咯羧醯胺，其中 R_1 係爲氫或甲基。

4.如申請專利範圍第 1 或 2 項之式 I 之三氟甲基吡咯羧醯胺，其中 R_2 係爲甲基。

5.如申請專利範圍第 1 或 2 項之式 I 之三氟甲基吡咯羧醯胺，其中 R_3 係爲苯基或經鹵素取代的苯基。

6.如申請專利範圍第 1 或 2 項之式 I 之三氟甲基吡咯羧醯胺，其中 R_1 係爲氫或甲基，R_2 係爲甲基，且 R_3 係爲苯基或經鹵素取代的苯基。

7.如申請專利範圍第 1 項之式 I 之三氟甲基吡咯羧醯胺，其係選自於以下所組成的族群：

N-(2-聯苯基)-1-甲基-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺，

N-(4'-氯-2-聯苯基)-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺，

N-(4'-氟-2-聯苯基)-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺，

N-[2-(4-氟苯基)-3-噻吩基]-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺，

N-[2-(4-氯苯基)-3-噻吩基]-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺，

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

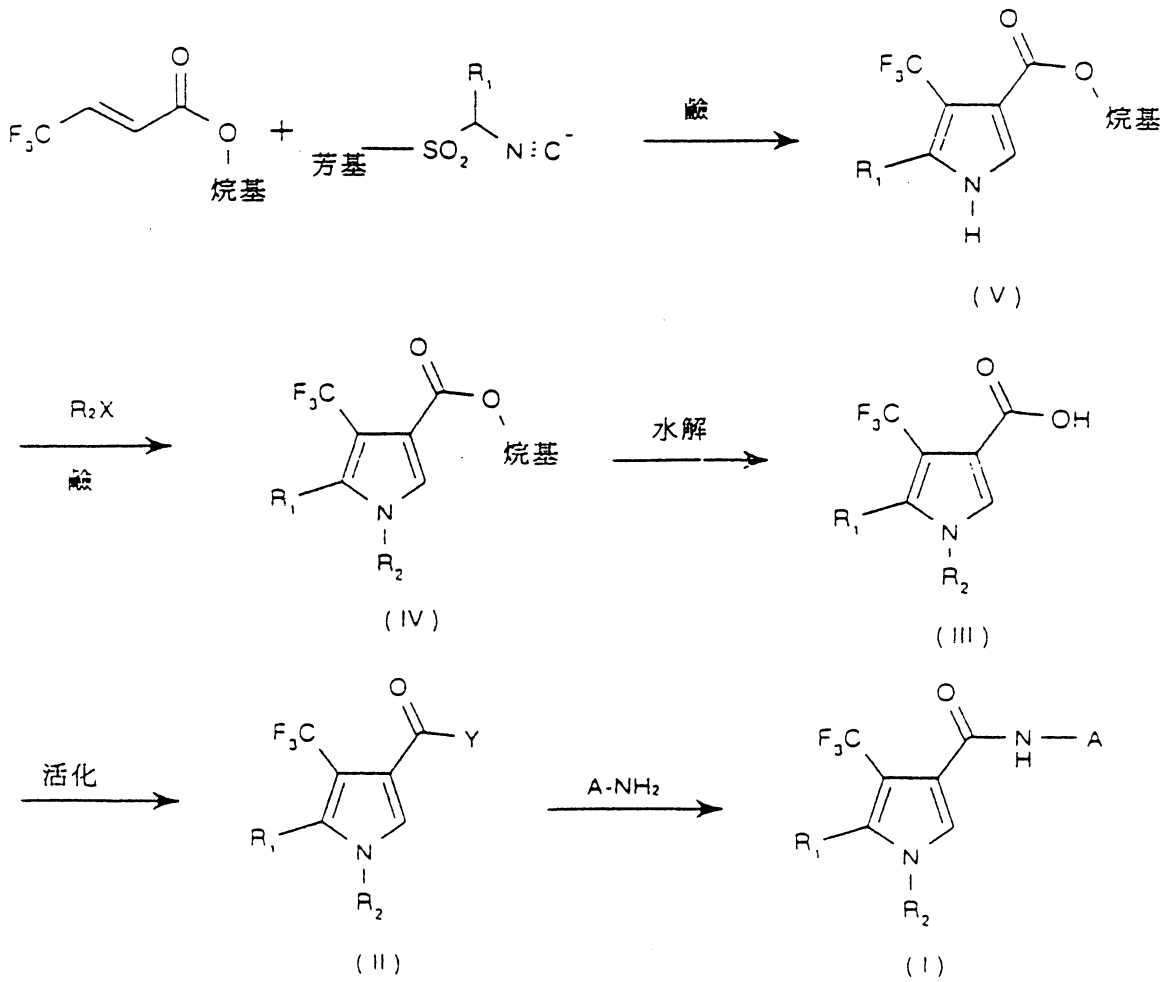
六、申請專利範圍

N-(3'4'-二氟-2-聯苯基)-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺，

N-(3'-三氟甲基-2-聯苯基)-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺，及

N-(4'-氯-3'-氟-2-聯苯基)-4-三氟甲基吡咯-3-羧醯胺。

8.一種製備如申請專利範圍第 1 項之式 I 之三氟甲基吡咯羧醯胺之方法，其包括依照以下流程來反應起始物質



經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

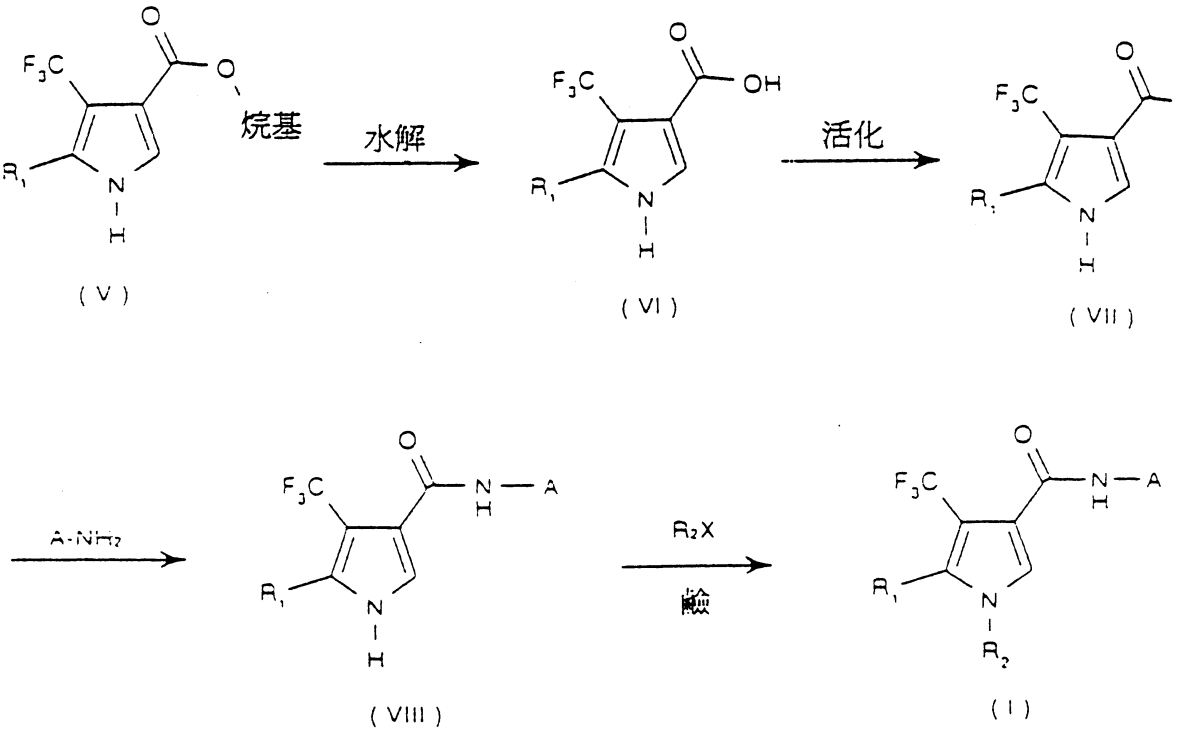
（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

六、申請專利範圍

其中 A、R_1 和 R_2 係如申請專利範圍第 1 項之式 I 中所定義，X 和 Y 係脫離基，烷基指 C_{1-6} 烷基，而芳基代表苯基或甲苯基。

9.一種製備如申請專利範圍第 1 項之式 I 之三氟甲基吡咯羧醯胺之方法，其包括依照以下流程來反應起始物質



(V)　(VI)　(VII)　(VIII)　(I)

其中 A、R_1 和 R_2 係如申請專利範圍第 1 項之式 I 中所定義，X 和 Y 係脫離基，烷基指 C_{1-6} 烷基，在醯胺化步驟期間視需要可利用一保護基。

10.一種用於控制植物致病性真菌及防止植物被其所侵

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線

六、申請專利範圍

襲和感染之組成物，其中活性成分係如申請專利範圍第 1 項之式 I 之三氟甲基吡咯羧醯胺連同一適當的載體。

11.一種用於控制或防止所裁培的植物被植物致病性真菌感染之方法，其係將如申請專利範圍第 1 項之式 I 之三氟甲基吡咯羧醯胺施予植物、它的部分或它的場所。

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）
裝
訂
線

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

本紙張尺度適用中國國家標準（CNS）A4規格（210×297公釐）