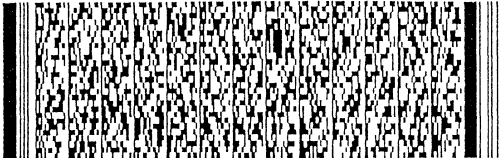
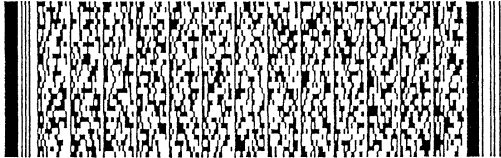


申請日期： 88.3.24	案號： 88104665	公 告 本
類別： A01N 25/00		

(以上各欄由本局填註)

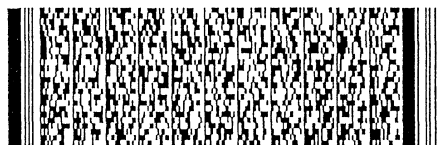
發明專利說明書		548078
一、 發明名稱	中文	基於叁(脲醚)衍生物及其他史卓畢林素類之殺真菌混合物
	英文	FUNGICIDAL MIXTURES BASED ON TRIS(OXIME ETHER) DERIVATIVES AND OTHER STROBILURINS
二、 發明人	姓名 (中文)	1. 克勞士 雪柏格 2. 湯瑪士 格羅特 3. 賀柏特 沙特 4. 伊柏哈德 艾莫曼
	姓名 (英文)	1. KLAUS SCHELBERGER 2. THOMAS GROTE 3. HUBERT SAUTER 4. EBERHARD AMMERMAN
	國籍	1. 奧地利 2. 德國 3. 德國 4. 德國
	住、居所	1. 德國高翰市屈米納路2號 2. 德國西弗斯泰德市布瑞拉爾街6號 3. 德國曼翰市尼卡波羅曼德街20號 4. 德國海佩翰市芬-蓋格恩街2號
三、 申請人	姓名 (名稱) (中文)	1. 德商巴地斯顏料化工廠
	姓名 (名稱) (英文)	1. BASF AKTIENGESELLSCHAFT
	國籍	1. 德國
	住、居所 (事務所)	1. 德國來恩河勞域沙芬市
	代表人 姓名 (中文)	1. 安德瑞斯·拜伯拜奇 2. 維拉·史塔克
	代表人 姓名 (英文)	1. ANDREAS BIEBERBACH 2. VERA STARK
 		

申請日期：	案號：
類別：	

(以上各欄由本局填註)

發明專利說明書

一、 發明名稱	中文	
	英文	
二、 發明人	姓名 (中文)	5. 吉瑟拉 羅倫茲 6. 西格弗德 史屈斯曼
	姓名 (英文)	5. GISELA LORENZ 6. SIEGFRIED STRATHMANN
	國籍	5. 德國 6. 德國
	住、居所	5. 德國那斯泰德市爾蘭路13號 6. 德國李柏格哈弗市多納柏格街9號
三、 申請人	姓名 (名稱) (中文)	
	姓名 (名稱) (英文)	
	國籍	
	住、居所 (事務所)	
	代表人 姓名 (中文)	
	代表人 姓名 (英文)	



本案已向

國(地區)申請專利

申請日期

案號

主張優先權

德國 DE

1998/03/24 19812764.2

有

有關微生物已寄存於

寄存日期

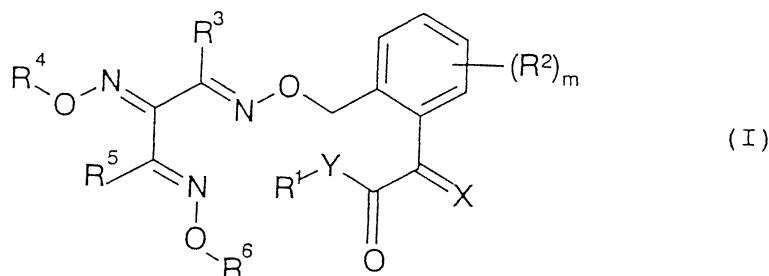
寄存號碼

無



五、發明說明 (1)

本發明係關於控制有害真菌之殺真菌混合物，包括
a) 式I之苯乙酸衍生物



其中取代基及參數具有下列定義：

X 係 NOCH_3 、 CHOCH_3 、 CHCH_3 ；

Y 係 O、NR

R^1 、R 分別各為氫及 C_1 - C_4 烷基；

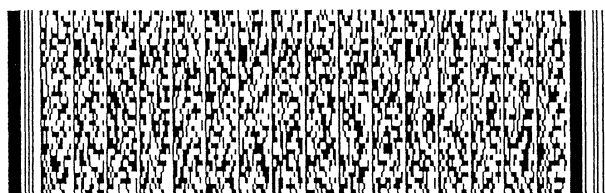
R^2 係 氰基、硝基、三氟甲基、鹵素、 C_1 - C_4 烷基及 C_1 - C_4 烷氧基；

m 係 0、1 或 2，其中若 m 係 2 則 R^2 基可相異；

R^3 係 氫、氰基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_3 - C_6 環烷基；

R^4 、 R^6 分別各為 氫，

C_1 - C_{10} 烷基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_2 - C_{10} 炔基、 C_1 - C_{10} 烷羰基、 C_2 - C_{10} 烯羰基、 C_3 - C_{10} 炔羰基或 C_1 - C_{10} 烷磺醯基，其中這些基可部份或完全鹵化或可帶有一至三個下列基：氰基、硝基、羥基、巰基、胺基、羧基、胺羰基、胺磺羰基、鹵素、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_1 - C_6 烷磺醯基、



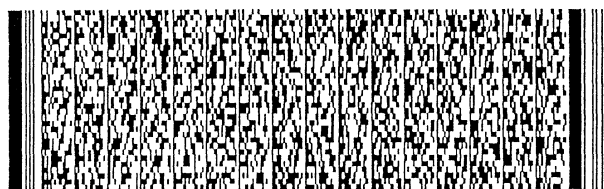
五、發明說明 (2)

C_1-C_6 烷亞磺醯基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_1-C_6 烷氧羰基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷胺基、二- C_1-C_6 烷胺基、 C_1-C_6 烷胺羰基、二- C_1-C_6 烷胺羰基、 C_1-C_6 烷胺硫羰基、二- C_1-C_6 烷胺硫羰基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 烯氧基、 C_3-C_6 環烷基、 C_3-C_6 環烷氧基、雜環基、雜環氧基、苄基、苄氧基、芳基、芳氧基、芳硫基、雜芳基、雜芳氧基及雜芳硫基，其中該部份之環基可部份或完全鹵化或可帶有一至三個下列基：氰基、硝基、羥基、巰基、胺基、羧基、胺羰基、胺硫羰基、鹵素、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_1-C_6 烷磺醯基、 C_1-C_6 烷亞磺醯基、雜芳硫基或 $C(=NOR^7)-A_n-R^8$ ；

芳基、芳羰基、芳磺醯基、雜芳基、雜芳羰基或雜芳磺醯基，其中這些基可部份或完全鹵化或可帶有一至三個下列基：氰基、硝基、羥基、巰基、胺基、羧基、胺羰基、胺硫羰基、鹵素、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_1-C_6 烷羰基、 C_1-C_6 烷磺醯基、 C_1-C_6 烷亞磺醯基、 C_3-C_6 環烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_1-C_6 烷氧羰基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷胺基、二- C_1-C_6 烷胺基、 C_1-C_6 烷胺羰基、二- C_1-C_6 烷胺羰基、 C_1-C_6 烷胺硫羰基、二- C_1-C_6 烷胺硫羰基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 烯氧基、苄基、苄氧基、芳基、芳氧基、雜芳基、雜芳氧基或 $C(=NOR^7)-A_n-R^8$ ；

R^5 係氫，

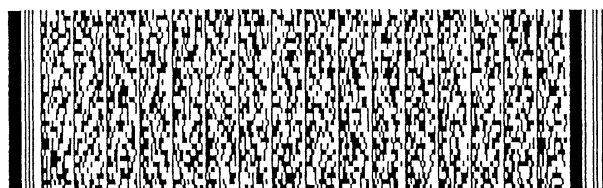
C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基，其中這些基之烴基可部份或完全鹵化或可帶有一至三個下列基：氰基、硝基、羥基、巰基、胺基、羧基、胺羰基、胺硫羰基、鹵



五、發明說明 (3)

素、 C_1-C_6 烷胺羰基、二- C_1-C_6 烷胺羰基、 C_1-C_6 烷胺硫羰基、二- C_1-C_6 烷胺硫羰基、 C_1-C_6 烷磺醯基、 C_1-C_6 烷亞磺醯基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_1-C_6 烷氧羰基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷胺基、二- C_1-C_6 烷胺基、 C_2-C_6 烯氧基、 C_3-C_6 環烷基、 C_3-C_6 環烷氧基、雜環基、雜環氧基、芳基、芳氧基、芳基- C_1-C_4 烷氧基、芳硫基；芳基- C_1-C_4 烷硫胺基、雜芳基、雜芳氧基、雜芳基- C_1-C_4 烷氧基、雜芳硫基、雜芳基- C_1-C_4 烷硫基、其中該部份之環基可部份或完全鹵化及／或可帶有一至三個下列基：氟基、硝基、羥基、巰基、胺基、羧基、胺羰基、胺硫羰基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷素、 C_1-C_6 烷磺醯基、 C_1-C_6 烷亞磺醯基、 C_3-C_6 環烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_1-C_6 烷氧羰基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷胺基、二- C_1-C_6 烷胺基、 C_1-C_6 烷胺羰基、二- C_1-C_6 烷胺羰基、 C_1-C_6 烷胺硫羰基、二- C_1-C_6 烷胺硫羰基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 烯氧基、芳基、芳氧基、芳基、芳氧基、芳硫基、雜芳基、雜芳氧基、雜芳硫基及 $C(=NOR^7)-A_n-R^8$ ；

C_3-C_6 環烷基、 C_3-C_6 環烯基、雜環基、芳基、雜芳基，其中環基可部份或完全鹵化或可帶有一至三個下列基：氟基、硝基、羥基、巰基、胺基、羧基、胺羰基、胺硫羰基、鹵素、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_1-C_6 烷磺醯基、 C_1-C_6 烷亞磺醯基、 C_3-C_6 環烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_1-C_6 烷氧羰基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷胺基、二- C_1-C_6 烷胺基、 C_1-C_6 烷胺羰基、二- C_1-C_6 烷胺羰基、 C_1-C_6 烷胺硫羰基、二- C_1-C_6 烷胺硫羰基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 烯氧基、



五、發明說明 (4)

基、氧基、芳基、芳氧基、雜芳基及雜芳氧基；

其中

A 係氧、硫或氮且其中氮帶有氫或 C_1-C_6 烷基；

n 係0或1；

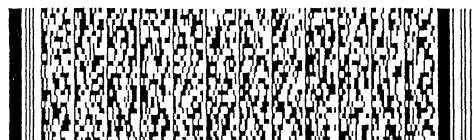
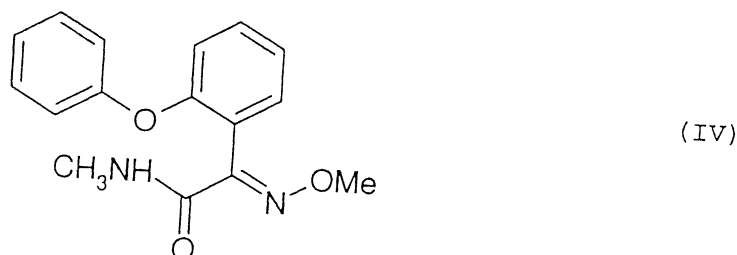
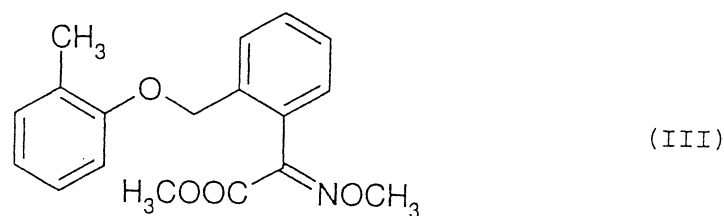
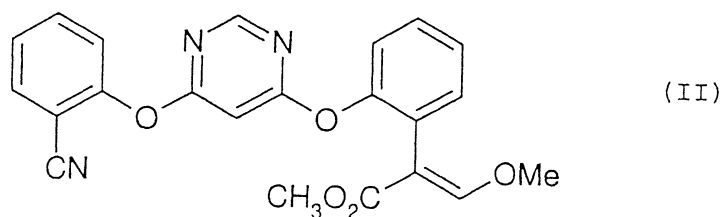
R^7 係氫或 C_1-C_6 烷基且

R^8 係氫或 C_1-C_6 烷基，

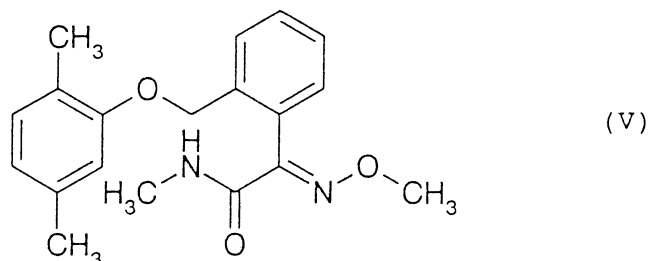
及其鹽，

與

b) 至少一種殺真菌劑選自式II至V之殺真菌劑



五、發明說明 (5)



本發明之標的係提供殺真菌混合物，其具有超過混合物中各成份自身活性之良好活性，尤其對抗稻米之真菌疾病。

吾等發現該標的可以申請專利範圍第1項所請之混合物達成。

式I化合物係本身已知的且見述於文獻(WO 97/15552)。

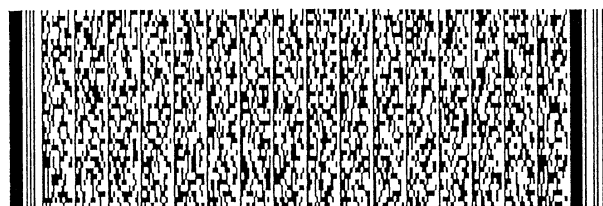
式II至V之殺真菌亦為已知的且見述於文獻。此外，彼等可視需要依下述括弧中所述商品名市售獲得：

II：俗名：azoxystrobin(商品名：Amistar[®]，來自Zeneca)；

III：EP-A 253,313，俗名：kresoxim-methyl(商品名：Brio[®]，來自BASF)；

IV：EP 398,692，建議俗名：metominostrobin(發展編碼SSF-126，來自Shionogi)；

V：EP 398,692，CAS RN 162535-21-9，SSF 129，



五、發明說明 (6)

Shionogi 有限公司之發展產品。

由於化合物 I 之 $C=C$ - 及 $C=N$ - 雙鍵，化合物 I 可由到呈 E/Z 異構物之混合物而獲得，其可以常規方式(例如結晶或色層分析)分成各個化合物。

若合成得到異構物混合物，通常不需分離，原因在某些情形中異構物在調配或施用期間(如曝光、酸或鹼)可彼此相互轉化。相似轉化作用亦可發生在施用後如在處理植物，或有害真菌或欲控制動物害蟲。

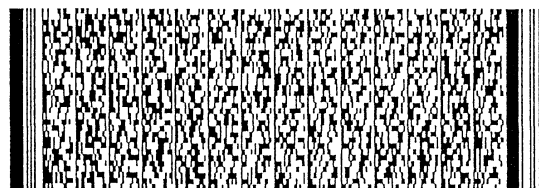
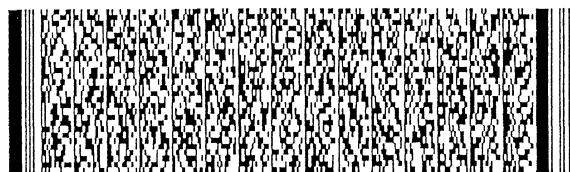
由 $C=X$ 雙鍵來看，化合物 I 之 E 型異構物係有較佳活性(以相對於 $-CO_2R^1$ 之 $-OCH_3$ 或 $-CH_3$ 基為主構型)。

由 $-C(R^3)=NOCH_2-$ 雙鍵來看，化合物 I 之順式異構物係有較佳活性(以相對於 $-OCH_2-$ 基之 R^3 基為主構型)。

於開始之化合物 I 之定義中，所用之集合性術語常代表下列取代基：

鹵素：氟、氯、溴及碘；

烷基：1 至 4、6 或 10 個碳原子之直鏈或支鏈烷基，例如 C_1-C_6 - 烷基，如甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙



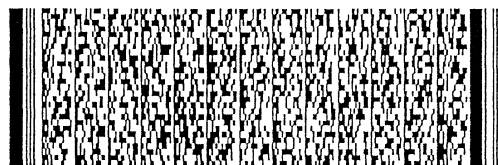
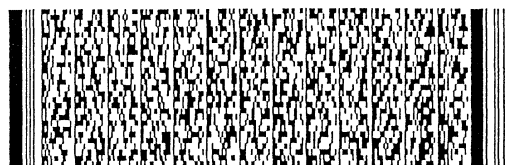
五、發明說明 (7)

基、1-乙基-1-甲基丙基及1-乙基-2-甲基丙基；

鹵烷基：1至6個碳原子之上述直鏈或支鏈烷基，其中這些基一些或全部之氫原子可由上述之鹵原子取代，例如 C_1-C_2 -鹵烷基，如氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基及五氟乙基；

環烷基：3至6個碳環員之單環烷基，例如環丙基、環丁基、環戊基及環己基；

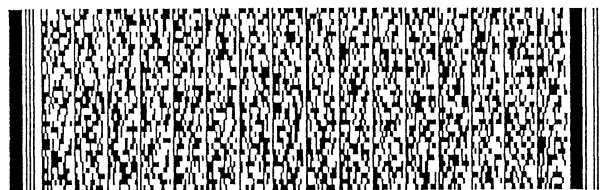
烯基：未飽和直鏈或支鏈且具2至6或10個碳原子及於任何位置上有一雙鍵之烴基，例如 C_2-C_6 -烯基如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-1-丁烯基、2-甲基-1-丁烯基、3-甲基-1-丁烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、1,2-二甲基-1-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-1-戊烯基、2-甲基-1-戊烯基、3-甲基-1-戊烯基、4-甲基-1-戊烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-2-戊烯



五、發明說明 (8)

基、4-甲基-2-戊烯基、1-甲基-3-戊烯基、2-甲基-3-戊烯基、3-甲基-3-戊烯基、4-甲基-3-戊烯基、1-甲基-4-戊烯基、2-甲基-4-戊烯基、3-甲基-4-戊烯基、4-甲基-4-戊烯基、1,1-二甲基-2-丁烯基、1,1-二甲基-3-丁烯基、1,2-二甲基-1-丁烯基、1,2-二甲基-2-丁烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,3-二甲基-1-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、1,3-二甲基-3-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-1-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、3,3-二甲基-1-丁烯基、3,3-二甲基-2-丁烯基、1-乙基-1-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-乙基-1-丁烯基、2-乙基-2-丁烯基、2-乙基-3-丁烯基、1,1,2-三甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯基、1-乙基-2-甲基-1-丙烯基及1-乙基-2-甲基-2-丙烯基；

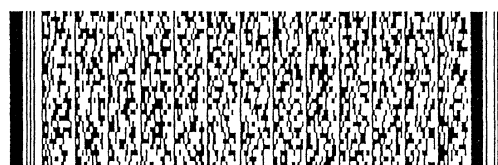
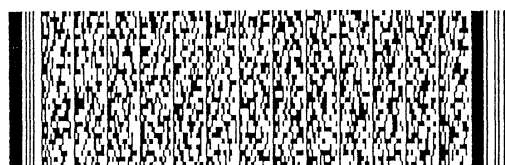
炔基：具2至10個碳原子及於任何位置有一個三鍵之直鏈或支鏈之烴基，例如 C_2-C_6 -炔基如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、3-甲基-1-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基、1-乙基-2-丙炔基、1-己炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、1-甲基-2-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-3-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、3-甲基-1-戊炔基、3-甲基-4-戊炔基、4-甲基-1-戊炔基、4-甲



五、發明說明 (9)

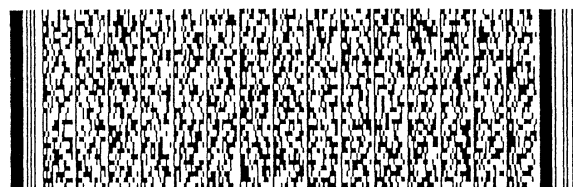
基-2-戊炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-3-丁炔基、1,2-二甲基-3-丁炔基、2,2-二甲基-3-丁炔基、3,3-二甲基-1-丁炔基、1-乙基-2-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-乙基-3-丁炔基及1-乙基-1-甲基-2-丙炔基；

雜環基或雜環氧基、雜環硫基及雜環胺基：3至6員，飽和或部份未飽和單或多環系雜環，其含1至3個選自氧、氮及硫之雜原子且其經由氧原子(雜環氧基)、或經由硫原子(雜環硫基)或經由氮原子(雜環胺基)直接鍵結至主鏈如2-四氫呋喃基，環氧乙烷基，3-四氫呋喃基，2-四氫噁吩基，3-四氫噁吩基，2-吡咯啉基，3-吡咯啉基，3-異噁唑啉基，4-異噁唑啉基，5-異噁唑啉基，3-異噻唑啉基，4-異噻唑啉基，5-異噻唑啉基，3-吡啶基，4-吡啶基，5-吡啶基，2-噁唑啉基，4-噁唑啉基，5-噁唑啉基，2-咪唑啉基，4-咪唑啉基，1,2,4-噁二唑啉-3-基，1,2,4-噁二唑啉-5-基，1,2,4-噻二唑啉-3-基，1,2,4-噻二唑啉-5-基，1,2,4-三唑啉-3-基，1,3,4-噁二唑啉-2-基，1,3,4-噻二唑啉-2-基，1,3,4-三唑啉-2-基，2,3-二氫呋喃-2-基，2,3-二氫呋喃-3-基，2,3-二氫呋喃-4-基，2,3-二氫呋喃-5-基，2,5-二氫呋喃-2-基，2,5-二氫呋喃-3-基，2,3-二氫噁吩-2-基，2,3-二氫噁吩-3-基，2,3-二氫噁吩-4-基，2,3-二氫噁吩-5-基，2,5-二氫噁吩-2-基，2,5-二氫噁吩-3-基，2,3-二氫吡咯-2-基，2,3-二氫吡咯-3-基，2,3-二氫吡咯-4-基，2,3-二氫吡咯-5-基，2,5-二氫吡咯-2-基，



五、發明說明 (10)

2, 5-二氫吡咯-3-基, 2, 3-二氫異唑啉-3-基, 2, 3-二氫異噁唑-4-基, 2, 3-二氫異噁唑-5-基, 4, 5-二氫異噁唑-3-基, 4, 5-二氫異噁唑-4-基, 4, 5-二氫異噁唑-5-基, 2, 5-二氫異噻唑-3-基, 2, 5-二氫異噻唑-4-基, 2, 5-二氫異噻唑-5-基, 2, 3-二氫異吡啉-3-基, 2, 3-二氫異吡啉-4-基, 2, 3-二氫異吡啉-5-基, 4, 5-二氫異吡啉-3-基, 4, 5-二氫異吡啉-4-基, 4, 5-二氫異吡啉-5-基, 2, 5-二氫異吡啉-3-基, 2, 5-二氫異吡啉-4-基, 2, 5-二氫異吡啉-5-基, 2, 3-二氫噁唑-3-基, 2, 3-二氫噁唑-4-基, 2, 3-二氫噁唑-5-基, 4, 5-二氫噁唑-3-基, 4, 5-二氫噁唑-4-基, 4, 5-二氫噁唑-5-基, 2, 5-二氫噁唑-3-基, 2, 5-二氫噁唑-4-基, 2, 5-二氫噁唑-5-基, 2, 3-二氫噻唑-2-基, 2, 3-二氫噻唑-4-基, 2, 3-二氫噻唑-5-基, 4, 5-二氫噻唑-2-基, 4, 5-二氫噻唑-4-基, 4, 5-二氫噻唑-5-基, 2, 5-二氫噻唑-2-基, 2, 5-二氫噻唑-4-基, 2, 5-二氫噻唑-5-基, 2, 3-二氫咪唑-2-基, 2, 3-二氫咪唑-4-基, 2, 3-二氫咪唑-5-基, 4, 5-二氫咪唑-2-基, 4, 5-二氫咪唑-4-基, 4, 5-二氫咪唑-5-基, 2, 5-二氫咪唑-2-基, 2, 5-二氫咪唑-5-基, 2-嗎啉基, 3-嗎啉基, 2-六氫吡啶基, 3-六氫吡啶基, 4-六氫吡啶基, 3-四氫嗒吡基, 4-四氫嗒吡基, 2-四氫嘧啶基, 4-四氫嘧啶基, 5-四氫嘧啶基, 2-四氫吡嗪基, 1, 3, 5-四氫三吡-2-基, 1, 2, 4-四氫三吡-3-基, 1, 3-二氫噁吡-2-基, 1, 3-二噻-2-基, 2-四氫呋喃基, 1, 3-二氧戊烷-2-基, 3, 4, 5, 6-四氫吡啶-2-



五、發明說明 (11)

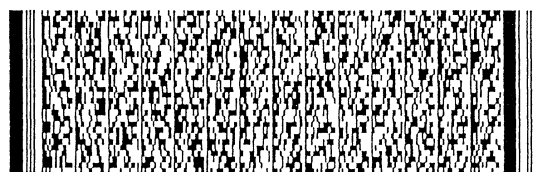
基，4H-1,3-噻吡-2-基，4H-3,1-苯并噻吡-2-基，1,1-二氧-2,3,4,5-四氫噻吩-2-基，2H-1,4-苯并噻吡-3-基，2H-1,4-苯并噁吡-3-基，1,3-二氫噁吡-2-基及1,3-二-2-基；

芳基或芳氧基，芳硫基，芳羰基和芳磺醯基：芳族單環或多環氫基，其直接或經由氧原子(-O-)(芳氧基)或硫原子(-S-)(芳硫基)，經由羰基(-CO-)(芳羰基)，經由磺醯基(-SO₂-)或(芳磺醯基)鍵結到主鏈上，例如，苯基，萘基和菲基，或苯氧基，萘氧基和菲氧基與對應的羰基和磺醯基；

雜芳基或雜芳氧基，雜芳硫基，雜芳胺基，雜芳羰基和雜芳磺醯基：芳族一環或多環基，其除了碳環員外另可含一至四個氮原子或含一至三個氮原子與一個氧或硫原子或含一個氧或硫原子者，且係直接地或經由氧原子(-O-)(雜芳氧基)或經由硫原子(-S-)(雜芳硫基)，經由羰基(-CO-)(雜芳基羰基)或經由磺醯基(-SO₂-)(雜芳磺醯基)等鍵結到主鏈上者；例如

- 含有一至三個氮原子之五員雜芳基：5員雜芳環基，除碳原子外可含1至3個氮原子當作環員如2-吡咯基，3-吡咯基，3-吡啶基，4-吡啶基，5-吡啶基，2-咪啶基，4-咪啶基，1,2,4-三唑-3基及1,3,4-三唑-2-基；

- 含1至4個氮原子或1至3個氮原子及1個硫或氧原子或1個氧或硫原子之5員雜芳基：具5員環之雜芳基，除碳原子外，可含1至4個氮原子或1至3個氮原子及1個硫或氧原子



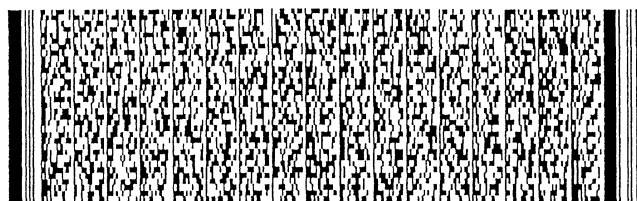
五、發明說明 (12)

或1個氧或硫原子為環員，例如2-呋喃基、3-呋喃基、2-噻吩基、3-噻吩基、2-吡咯基、3-吡咯基、3-異噁唑基、4-異噁唑基、5-異噁唑基、3-異噻唑基、4-異噻唑基、5-異噻唑基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡唑基、2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基、2-噻唑基、4-噻唑基、5-噻唑基、2-咪唑基、4-咪唑基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1,2,4-三唑-3-基、1,3,4-噁二唑-2-基、1,3,4-噻二唑-2-基、1,3,4-三唑-2-基；

- 含1至3個氮原子或1個氮原子及/或1個氧或硫原子之苯並稠合5-員雜芳基：具5員環之雜芳基，除碳原子外可含1至4個氮原子或1至3個氮原子及1個硫或氧原子為環員，且其中兩鄰接之碳環員或1個氮及1個鄰接碳環員可由丁-1,3-二烯-1,4-二基橋聯；

- 經由氮鍵結且含1至4個氮原子之5-員雜芳基或經由氮鍵結且含1至3個氮原子之苯並稠合5員雜芳基：具5員環之雜芳基，除碳原子外可含1至4個氮原子或1至3個氮原子為環員，且其中兩鄰接碳環員或1個氮及1個鄰接碳環員可由丁-1,3-二烯-1,4-二基橋聯，此等環經由氮環員中之一鍵結於主鏈；

- 含1至3個或1或4個氮原子之6員雜芳基：具6員環之雜芳基，除碳原子外可含1至3個或1至4個氮原子為環員，例如2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、3-嗒吡基、4-嗒吡基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、5-嘧啶基、2-吡嗪基、1,3,5-



五、發明說明 (13)

三吡啶-2-基、1, 2, 4-三吡啶-3-基及1, 2, 4, 5-四吡啶-3-基；

- 含1至4個氮原子之苯并稠合6員雜芳基：6員雜芳環基，其中二個相鄰接碳環員可由丁-1, 3-二烯-1, 4-二基橋聯如喹啉、異喹啉、喹啉及喹啉，及對應氧、硫、羰基或磺基。

雜芳胺基：芳族一環或多環基，其除了碳環員外另可含一至四個氮原子或含一至三個氮原子與一個氧或一個硫原子，且係直接地鍵結到主鏈上者。

術語"部份或完全鹵化表"示基團中一些或全部氮原子可被相同或相異如上述鹵素原子替代。

有關其生物活性，較佳者係式I之化合物，其中m係0。

同樣地，較佳者係式I化合物，其中R¹係甲基。

此外，較佳者係化合物I，其中R³係氫、氟基、環丙基、甲基、乙基、1-甲乙基或CF₃。

另外，較佳者係化合物I，其中R³係甲基。

此外，較佳者係化合物I，其中R³係氟基。

另外，較佳者係化合物I，其中R³係環丙基。

此外，較佳者係化合物I，其中R³係CF₃。

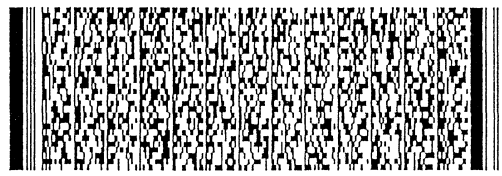
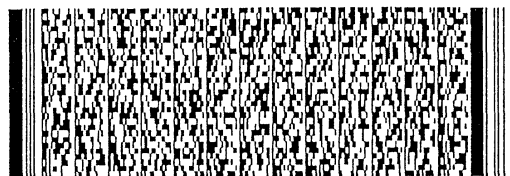
另外，較佳者係化合物I，其中R⁵係氫、環丙基、甲基、乙基、異丙基、未經取代或經取代芳基或雜芳基。

此外，較佳者係化合物I，其中R⁵係甲基。

另外，較佳者係化合物I，其中R⁵係乙基。

此外，較佳者係化合物I，其中R⁵係異丙基。

此外，較佳者係化合物I，其中R⁵係環丙基。



五、發明說明 (14)

此外，較佳者係化合物I，其中R⁵係CF₃。

另外，較佳者係化合物I，其中R⁵係未經取代或經取代芳基或雜芳基。

另外，較佳者係化合物I，其中R⁵係未經取代或經取代吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、噻嗪基或三嗪基。

另外，較佳者係化合物I，其中R⁵係未經取代或經取代咪唑基、噻吩基或吡咯基。

此外，較佳者係化合物I，其中R⁵係未經取代或經取代噁唑基、噻唑基、異噁唑基、異噻唑基、吡咯基或噻唑基。

此外，較佳者係化合物I，其中R⁵係未經取代或經取代噁二唑基、噻二唑基或三唑基。

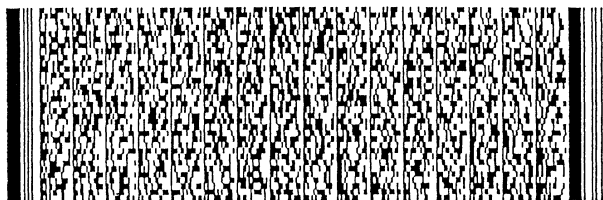
另外，較佳者係化合物I，其中R⁵係苯基，其未經取代或帶有一至二個下列基：硝基、氰基、羥基、胺基、胺羰基、胺硫羰基、鹵素、C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄烷胺基、二-C₁-C₄烷胺基、C₁-C₄烷磺醯基、C₁-C₄烷氧羰基、C₁-C₄烷胺羰基或二-C₁-C₄烷胺羰基。

另外，較佳者係化合物I，其中R⁴係氫、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、烯丙基、芳烷基、雜芳烷基、芳氧烷基、雜芳氧烷基、芳基或雜芳基。

另外，較佳者係化合物I，其中R⁴係C₁-C₆烷基。

另外較佳化合物I係揭示於WO 97/15,552。

含於本發明之混合物之化合物I具有對抗廣泛植物病原

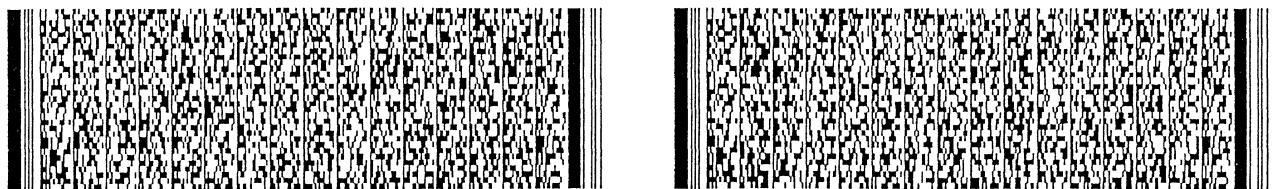


五、發明說明 (15)

性真菌，尤其是來自子囊菌綱、半知菌綱、薄狀菌綱及擔子菌綱之良好活性。

彼等對控制各種作物如棉花、蔬菜(例如黃瓜、豆類、蕃茄、馬鈴薯及葫蘆)、大麥、青草、燕麥、香蕉、咖啡、玉米、水果、稻米、玉米、黑麥、大豆、葡萄、小麥、觀賞植物、甘蔗及多種種子上之許多真菌特別重要。

其特別適用於防治下列植物致病性真菌：穀類之禾白粉菌(*Erysiphe graminis*)，葫蘆之二孢白粉菌(*Erysiphe cichoracearum*)及單絲殼(*Sphaerotheca fuliginea*)，蘋果之白叉絲單囊殼(*Podosphaera leucotricha*)，葡萄之葡萄鈎絲殼(*Uncinula necator*)，穀類之柄銹菌(*Puccinia species*)物種，棉花、稻及草地之絲殼菌(*Rhizoctonia species*)物種，穀類及甘蔗之黑粉菌(*Ustilago species*)物種，蘋果之蘋果黑星菌(*Venturia inaequalis*) (瘡痂病)，穀類之長蠕孢(*Helminthosporium species*)物種，小麥之穎枯殼針孢(*Septoria nodorum*)，草莓、蔬菜、裝飾性植物及葡萄之灰葡萄孢(*Botrytis cinerea*) (灰黴)，落花生之落花生尾孢(*Cercospora arachidicola*)，小麥及大麥之假小尾孢(*Pseudocercospora herpotrichoides*)，稻之稻瘟菌(*Pyricularia oryzae*)，馬鈴薯及蕃茄之致病疫黴(*Phytophthora infestans*)，葡萄之葡萄生單軸黴(*Plasmopara viticola*)，蛇麻草及胡瓜之假霜黴(*Pseudoperonospora species*)物種，蔬菜及水果之鏈格



五、發明說明 (16)

孢(*Alternaria species*)物種，香蕉之球腔菌(*Mycosphaerella species*)物種及鐮孢(*Fusarium*)及輪枝孢(*Verticillium*)物種。

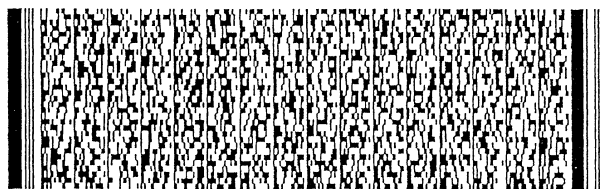
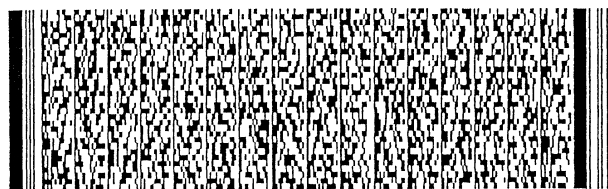
當作殺真菌劑之化合物II-V係市售的。

當製備混合物中，最好用純活性成份I與II-V且對抗有害真菌與害蟲如昆蟲、蟎或線蟲之另外活性成份或其他除草劑或生長調節劑之活性成份或其它肥料合用。

化合物I與至少一種化合物II-V之混合物可同時、接連或分別施用且具有對抗廣泛植物病原性真菌，尤其是來自子囊菌綱、半知菌綱、薄狀菌綱及擔子菌綱之顯著活性。有些係全面性作用因而適用作葉及土壤作用之殺真菌劑。

彼等對控制各種作物如棉花、蔬菜(例如黃瓜、豆類、蕃茄、馬鈴薯及葫蘆)、大麥、青草、燕麥、香蕉、咖啡、玉米、水果、稻米、玉米、黑麥、大豆、葡萄、小麥、觀賞植物、甘蔗及多種種子上之許多真菌特別重要。

其特別適用於防治下列植物致病性真菌：穀類之禾白粉菌(*Erysiphe graminis*)，葫蘆之二孢白粉菌(*Erysiphe cichoracearum*)及單絲殼(*Sphaerotheca fuliginea*)，蘋果之白叉絲單囊殼(*Podosphaera leucotricha*)，葡萄之葡萄鈎絲殼(*Uncinula necator*)，穀類之柄銹菌(*Puccinia species*)物種，棉花、稻及草地之絲殼菌(*Rhizoctonia species*)物種，穀類及甘蔗之黑粉菌(*Ustilago species*)物種，蘋果之蘋果黑星菌(*Venturia inaequalis*)(瘡痂病)，穀類之長蠕孢(*Helminthosporium*



五、發明說明 (17)

species) 物種，小麥之穎枯殼針孢(*Septoria nodorum*)，草莓、蔬菜、裝飾性植物及葡萄之灰葡萄孢(*Botrytis cinerea*) (灰黴)，落花生之落花生尾孢(*Cercospora arachidicola*)，小麥及大麥之假小尾孢(*Pseudocercospora herpotrichoides*)，稻之稻瘟菌(*Pyricularia oryzae*)，馬鈴薯及蕃茄之致病疫黴(*Phytophthora infestans*)，葡萄之葡萄生單軸黴(*Plasmopara viticola*)，蛇麻草及胡瓜之假霜黴(*Pseudoperonospora species*) 物種，蔬菜及水果之鏈格孢(*Alternaria species*) 物種，香蕉之球腔菌(*Mycosphaerella species*) 物種及鐮孢(*Fusarium*) 及輪枝孢(*Verticillium*) 物種。

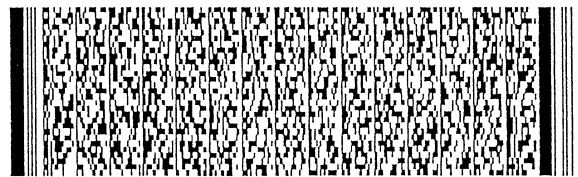
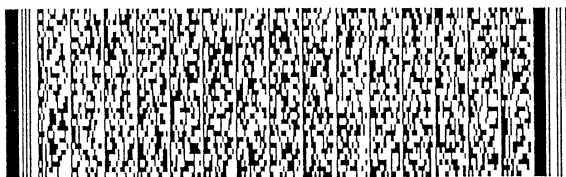
本發明之混合物特別適用控制稻瘟菌。

化合物I與至少一種化合物II-V之混合物可一起或分別同時施用或循序施用，於分別施用時、順序通常對控制結果無任何影響。

視所需效果種類而定，本發明混合物之施用率(尤其是農業作物)自0.01至8公斤/公頃，較好0.1至5公斤/公頃，尤其是0.5至3.0公斤/公頃。

化合物I之施用率為0.01至2.5公斤/公頃，較好0.05至2.5公斤/公頃，尤其是0.1至1.0公斤/公頃。

對應地，化合物II至V之例中，施用率係自0.001至5公斤/公頃，較好0.005至2公斤/公頃，尤其是0.01至1.0公斤/公頃。



五、發明說明 (18)

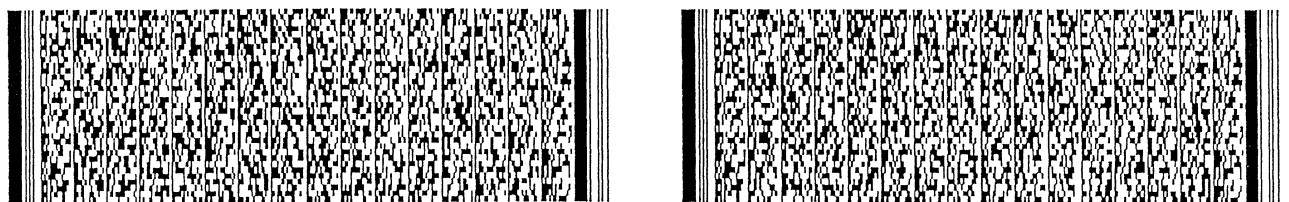
對種子處理而言，混合物之施用率通常自0.001至250克/公斤種子，較好0.01至100克/公斤，尤其是0.01至50克/公斤。

若欲防治植物致病性有害真菌，則化合物I及至少一種II至V之分別或一起施用，可藉對種子、植物或植物播種前或後之土壤、或植物萌發前或後，噴霧或撒粉而進行。

本發明之殺真菌協同混合物可調配成立即噴霧之溶液、粉末及懸浮液態或調配成高度濃縮水性、油性或其他懸浮液、分散液、乳液、油分散液、糊劑、粉劑、供散播之物質或顆粒態，並藉噴霧、霧化、撒粉、散播或撒水施用。使用狀態視所欲目的而異；任何例中，須儘可能確使本發明混合物分佈細密及均勻。

該調配物係依已知方式製備，例如以溶劑及/或載體及若需要則使用乳化劑及分散劑稀釋該活性成分，若使用水作為稀釋劑則亦可使用其他溶劑作為輔助溶劑。此目的之適宜輔助劑基本上如下：溶劑如芳族(如二甲苯)、氯化芳族(如氯苯)、鏈烷(礦油餾份)、醇類(如甲醇、丁醇)、酮類(如環己酮)、胺類(如乙醇胺、二甲基甲醯胺)及水；載劑如研磨天然礦物(如高嶺土、黏土、滑石、白堊)及研磨合成礦物(如細粒氧化矽、矽酸鹽)；乳化劑如非離子性及陰離子性乳化劑(如聚氧乙烯脂肪醇醚、烷磺酸酯及芳磺酸酯)及分散劑如木質亞硫酸鹽廢液及甲基纖維素。

適宜之界面活性劑為芳族磺酸如木質-、酚-、萘-及二丁基萘磺酸之鹼金屬鹽、鹼土金屬鹽及銨鹽，脂肪酸、烷



五、發明說明 (19)

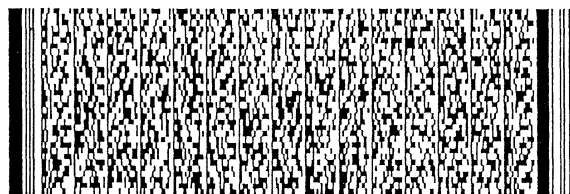
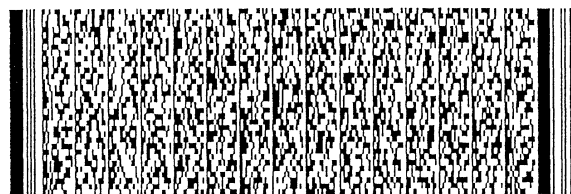
基、及烷芳基磺酸之鹼金屬鹽、鹼土金屬鹽及銨鹽，烷基月桂醚及脂肪醇硫酸鹽，及硫酸化十己-、十七-及十八烷醇之鹽，或脂肪醇二醇醚之鹽，磺酸化萘及其衍生物與甲醛之縮合物、萘或萘磺酸與酚及甲醛之縮合物，聚氧乙烯辛基酚醚、乙氧化異辛基-、辛基或壬基-酚、烷基酚聚二醇醚、三丁基苯基聚二醇醚、烷芳基聚醚醇、異十三烷醇、脂肪醇/環氧乙烷縮合物、乙氧化蓖麻油、聚氧乙烯烷基醚或聚氧丙烯烷基醚、月桂醇聚二醇醚乙酸酯、山梨糖醇酯、木質亞硫酸廢液或甲基纖維素。

粉末、供散播之物質及粉劑可藉混合或一起研磨化合物 I 及至少一種化合物 II 至 V、或化合物 I 及至少一種化合物 II 至 V 之混合物，與固體載體而製備。

顆粒劑(如包衣顆粒、浸潤顆粒或均質顆粒)一般係使活性成分(或諸活性成分)結合至固體載體上而製備。

填料或固體載體為例如礦土如氧化矽、矽膠、矽酸鹽、滑石、高嶺土、石灰石、石灰、白堊、紅玄武土、黃土、黏土、白雲石、矽藻土、硫酸鈣、硫酸鎂、氧化鎂、研磨合成材料及肥料如硫酸銨、磷酸銨、硝酸銨、尿素、及植物來源之產物如穀粉、樹皮粉、木粉及堅果殼粉、纖維素粉末或其他固體載體。

此調配物通常包括自 0.1 至 95 重量%，較好 0.5 至 90 重量% 之任一化合物 I 及至少一種化合物 II 至 V 或化合物 I 與至少一種 II 至 V 之混合物。活性成分使用純度自 90% 至 100%，較好 95% 至 100% 者(依 NMR 光譜或 HPLC 測定)。



五、發明說明 (20)

對應調配物可以殺真菌有效量之混合物或殺真菌有效量之化合物I及至少一種化合物II至V化合物（分別施用之例中處理有害真菌、其棲息處、或欲防治真菌之植物、種子、土壤、區域、材料或空間免受侵害。

施用可在受有害真菌感染前後進行。

此種包括活性成分之製劑實例為：

I. 含90重量份活性成分及10重量份N-甲基吡咯烷酮之溶液；此溶液宜以微滴劑使用；

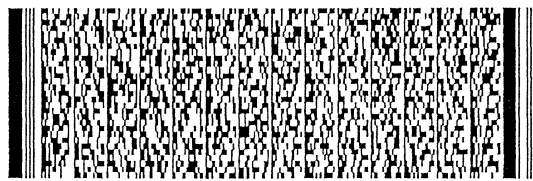
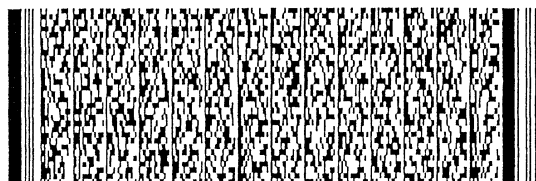
II. 含20重量份活性成分、80重量份二甲基、10重量份之8至10莫耳環氧乙烷與1莫耳油酸N-單乙醇醯胺之加成物、5重量份十二烷基苯磺酸鈣鹽、5重量份之40莫耳環氧乙烷與1莫耳蓖麻油之加成物之混合物；藉使此溶液微細分佈於水中獲得分散液；

III. 含20重量份活性成分、40重量份環己酮、30重量份異丁醇、20重量份之40莫耳環氧乙烷與1莫耳蓖麻油之加成物之水性分散液；

IV. 含20重量份活性成分、25重量份環己醇、65重量份沸點210至280°C之礦油餾份及10重量份之40莫耳環氧乙烷與1莫耳蓖麻油之加成物之水性分散液；

V. 於錘磨機中研磨之含80重量份活性成分、3重量份二異丁基萘-1-磺酸鈉鹽、10重量份得自亞硫酸鹽廢液之木質磺酸鈉鹽及7重量份粉碎矽膠之混合物；藉微細分佈該混合物於水中獲得噴霧混合物；

VI. 3重量份活性成分及97重量份細粒高嶺土之緊密混



五、發明說明 (22)

20-22 (1967)] 測定活性成分混合物之預期效率並與所觀察之效率比較。

$$\text{柯比程式} : E = x + y - x \cdot y / 100$$

E 當使用濃度a及b之活性成分A及B之混合物時，以未處理對照組之%表示之預期效率

x 當使用濃度a之活性成分A時，以未處理對照組之%表示之效率

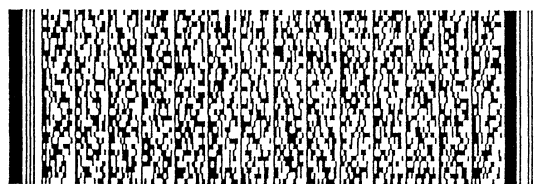
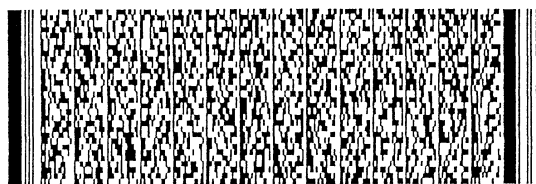
y 當使用濃度b之活性成分B時，以未處理對照組之%表示之效率

使用實例1：對抗稻瘟菌之活性(保護)

用活性成分之水性製劑噴灑盆栽稻苗"台農67"之葉片至濕答答為止，該製劑係由含10%活性成分，63%環己酮及27%乳化劑之貯液所製備。次日，用稻瘟菌之水性孢子懸浮液接種植物。接著將受試植物置於22-24°C及95-99%相對濕度之溫室6天。然後目測葉片感染之進展程度。

受感染葉面積百分比之目視測定值以對未處理對照組之百分比表示轉化成效率。效率0表示如未處理對照組相同之疾病程度，效率100表示0%疾病。使用柯比程式(Colby, S.R. "Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide combinations", Weeds, 15, 第20-22頁, 1967)測定活性成分組合物之預期效率並與觀察效率比較。

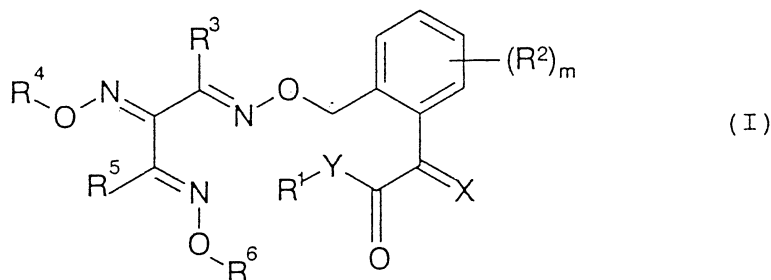
所用化合物I為下列成分a)：



四、中文發明摘要 (發明之名稱：基於叁(肟醚)衍生物及其他史卓畢林素類之殺真菌混合物)

殺真菌混合物，包括呈協同活性量當作活性成分

a) 式I之苯乙酸衍生物

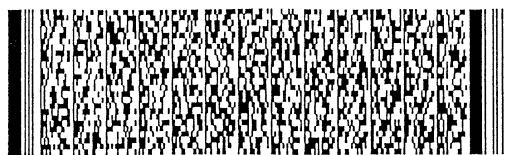
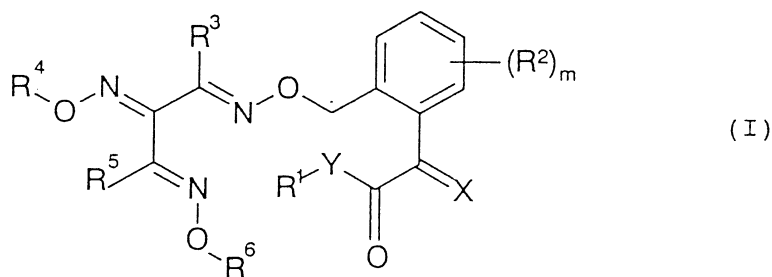


其中取代基及參數各如文中所述定義，及其鹽，
及

英文發明摘要 (發明之名稱：FUNGICIDAL MIXTURES BASED ON TRIS(OXIME ETHER) DERIVATIVES AND OTHER STROBILURINS)

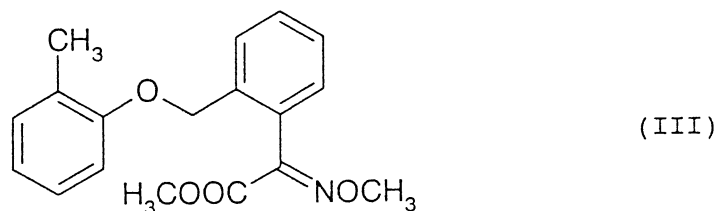
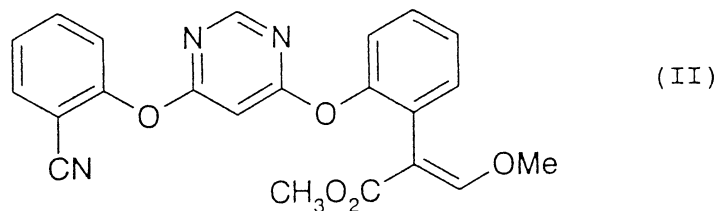
Fungicidal mixtures, comprising as active components

a) phenylacetic acid derivatives of the formula I



四、中文發明摘要 (發明之名稱：基於叁(肟醚)衍生物及其他史卓畢林素類之殺真菌混合物)

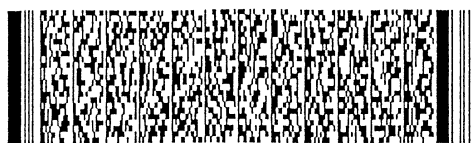
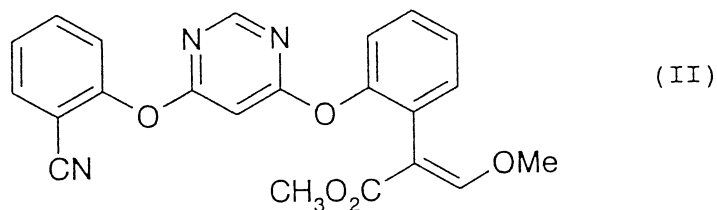
b) 至少一種式II至V之化合物



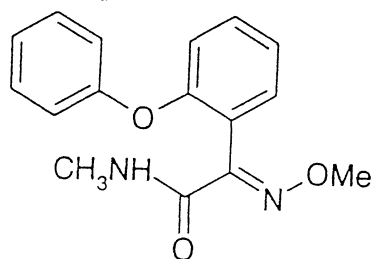
英文發明摘要 (發明之名稱：FUNGICIDAL MIXTURES BASED ON TRIS(OXIME ETHER) DERIVATIVES AND OTHER STROBILURINS)

in which the substituents and the index are each as defined in the description, and salts thereof, and

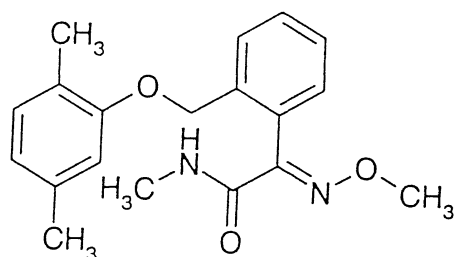
b) at least one compounds of the formulae II to V



四、中文發明摘要 (發明之名稱：基於叁(肟醚)衍生物及其他史卓畢林素類之殺真菌混合物)

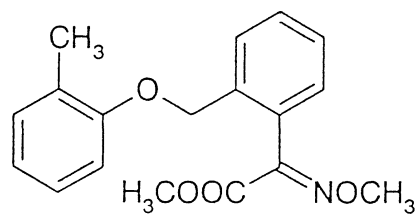


(IV)

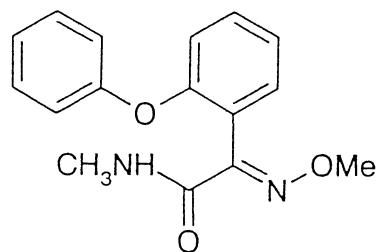


(V)

英文發明摘要 (發明之名稱：FUNGICIDAL MIXTURES BASED ON TRIS(OXIME ETHER) DERIVATIVES AND OTHER STROBILURINS)



(III)

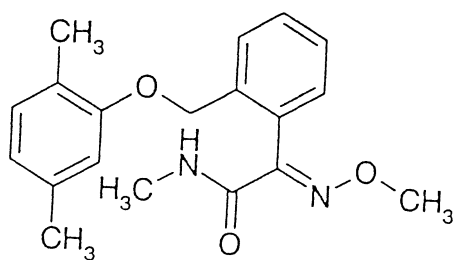


(IV)



四、中文發明摘要 (發明之名稱：基於叁(肟醚)衍生物及其他史卓畢林素類之殺真菌混合物)

英文發明摘要 (發明之名稱：FUNGICIDAL MIXTURES BASED ON TRIS(OXIME ETHER) DERIVATIVES AND OTHER STROBILURINS)



(v)

in a synergistically effective amount.



五、發明說明 (21)

公告本

修正
92年1月2日
補充

合物；此粉塵包括3重量%活性成分；

VII. 30重量活性成分、92重量份粉碎矽膠及8重量份已噴霧至此矽膠表面之石蠟油之緊密混合物；此調配物賦與活性成分良好黏著性；

VIII. 40重量份活性成分、10重量份酚磺酸/脲/甲醛縮合物之鈉鹽、2重量份矽膠及48重量份水之安定水性分散液；此分散液可再經稀釋；

IX. 20重量份活性成分、2重量份十二烷基苯磺酸鈣鹽、8重量份脂肪醇聚二醇醚、20重量份酚磺酸/脲/甲醛縮合物之鈉鹽及88重量份石蠟礦油之安定油性分散液。

使用實例

本發明之混合物之協同活性依據下列實驗證明：

活性成分(分別或一起)調配成於含63重量%環己酮及27重量%乳化劑之混合物中之10%乳液，並以水稀釋至所需濃度。

藉測定受感染葉片面積百分比進行評估。該等百分比轉化成效率。效率(W)使用亞伯特氏(Abbot's)方程式如下計算：

$$W = (1 - \alpha / \beta) \cdot 100$$

α 相當於經處理植物受真菌感染之%，及

β 相當於未處理植物受真菌感染之%。

效率0表示經處理植物受感染程度相當於未處理之對照組植物；效率100表示經處理植物未受感染。

使用柯比(Colby's)方程式[R. S. Colby, Weeds 15,



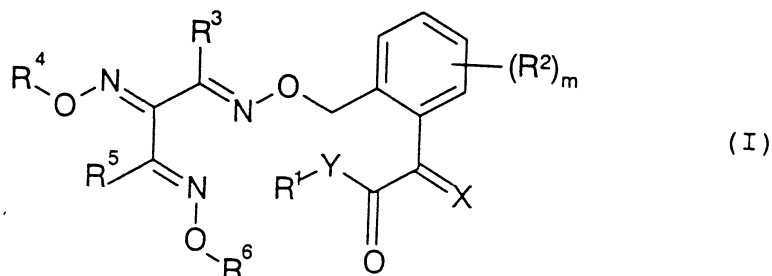
六、申請專利範圍

公告本

修正

1. 一種作物保護之混合物，其包括呈協同有補量當作活性成分之

a) 式I之苯乙酸衍生物



其中取代基及參數具有下列定義：

X 係 NOCH_3 、 CHOCH_3 、 CHCH_3 ；

Y 係 O、NR

R^1 、 R^6 分別各為氫及 C_1 - C_4 烷基；

R^2 係 氟基、硝基、三氟甲基、鹵素、 C_1 - C_4 烷基及 C_1 - C_4 烷氧基；

m 係 0、1 或 2，其中若 m 係 2 則 R^2 基可相異；

R^3 至 R^5 分別各為 C_1 - C_4 烷基，

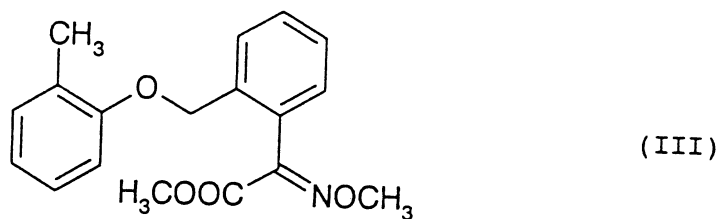
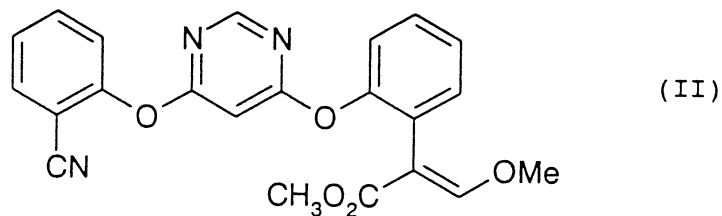
及其鹽，

與

b) 至少一種式II與式III之化合物

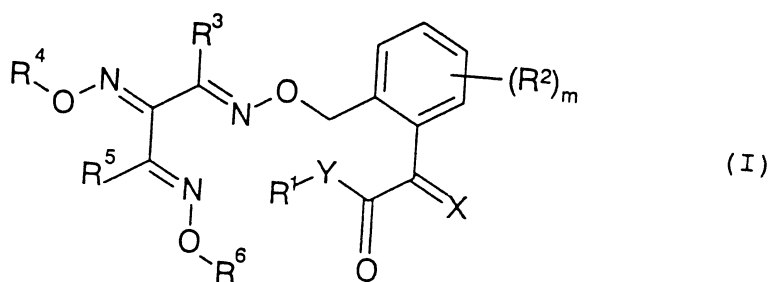


六、申請專利範圍



2. 根據申請專利範圍第1項之殺真菌混合物，係調整成兩部份，其中一部份包括於固體或液體載體中之式I之化合物，而另一部份包括於固體或液體載體中至少一種式II與式III之化合物。

3. 一種防治有害真菌之方法，包括以協同有效量之
a) 式I之苯乙酸衍生物



六、申請專利範圍

其中取代基及參數具有下列定義：

X 係 NOCH_3 、 CHOCH_3 、 CHCH_3 ；

Y 係 O、NR

R^1 、 R 分別各為氫及 C_1 - C_4 烷基；

R^2 係 氟基、硝基、三氟甲基、鹵素、 C_1 - C_4 烷基及 C_1 - C_4 烷氧基；

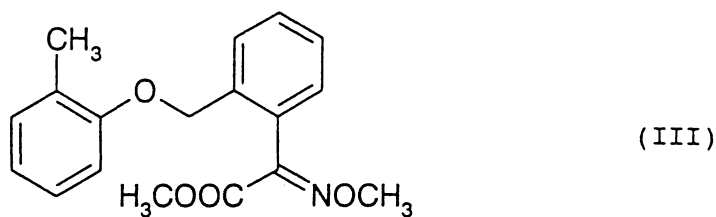
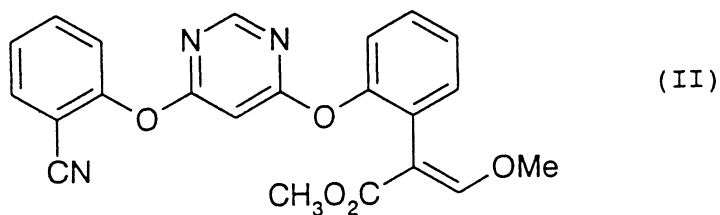
m 係 0、1 或 2，其中若 m 係 2 則 R^2 基可相異；

R^3 至 R^6 分別各為 C_1 - C_4 烷基，

及其鹽，

與

b) 至少一種式 II 與式 III 之化合物



六、申請專利範圍

處理真菌，其棲息處，或欲防治真菌免受其侵害之材料、植物、種子、土壤、區域或空間，其中式I之化合物及至少一種式II與III之化合物可同時、一起或分別或依序施用。

4. 根據申請專利範圍第3項之方法，其中有害真菌，其棲息處，或欲防治真菌免受其侵害之材料、植物、種子、土壤、區域或空間係用0.005至1公斤／公頃之式I之化合物處理。

5. 根據申請專利範圍第3項之方法，其中有害真菌，其棲息處，或欲防治真菌免受其侵害之材料、植物、種子、土壤、區域或空間係用0.01至1公斤／公頃之至少一種式II與III之化合物處理。

