

公 告 本

A4
C4

申請日期	88. 3. 24
案 號	88104666
類 別	A01N 33/6

(以上各欄由本局填註)

585740

發 明 專 利 說 明 書

一、發明 名稱	中 文	以叁(肟醚)衍生物及另外殺真菌劑為主之殺真菌混合物
	英 文	FUNGICIDAL MIXTURES BASED ON TRIS(OXIME ETHER) DERIVATIVES AND FURTHER FUNGICIDES
二、發明 人	姓 名	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 5.吉瑟拉 羅倫茲 6.西格弗德 史屈斯曼
	國 籍	1.奧地利 2.-6.均德國
	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 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)	德商巴地斯顏料化工廠
	國 籍	德國
	住、居所 (事務所)	德國來恩河勞域沙芬市
	代 表 人 姓 名	1.安德瑞斯·拜伯拜奇 2.維拉·史塔克

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大 類：
I P C 分類：

A6
B6

本案已向：

國（地區）

申請專利，申請日期：

案號：

，☐有 ☐無主張優先權

德國

1998年03月24日

19812759.6

☒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）

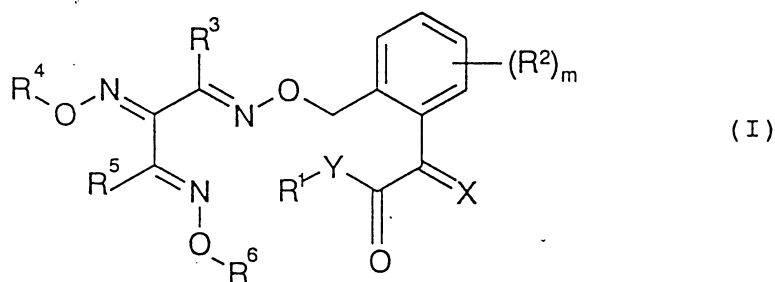
裝
訂

經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

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，包括呈協同有效量

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

五、發明說明(2)

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_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、 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、芳硫基、雜芳基、雜芳氧基、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

(請先閱讀背面之注意事項再寫本頁)

裝、訂、線

五、發明說明 (3)

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_2-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、鹵素、 C_1-C_6 烷基羰基、
 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：氰基、硝基、羥基、巰基、胺基、羧基、胺

(請先閱讀背面之注意事項
 再寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(4)

羰基、胺硫羰基、 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、苄基、苄氧基、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：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、 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；

五、發明說明 (5)

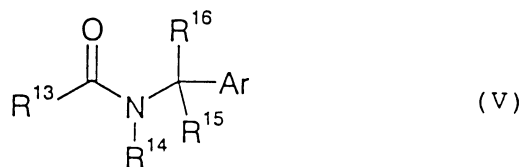
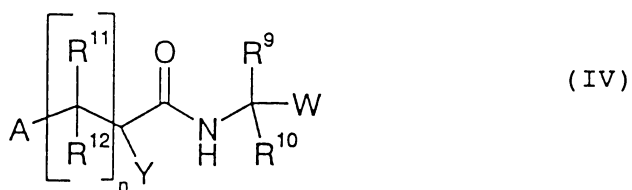
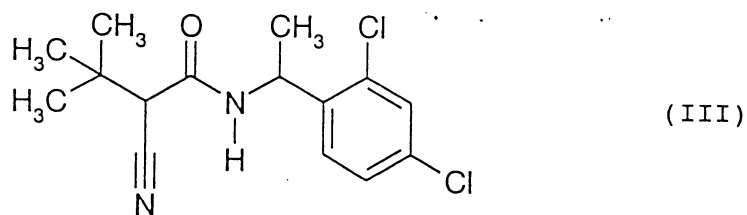
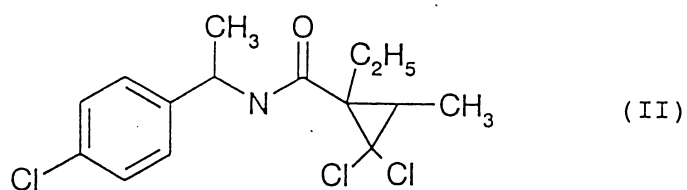
R^7 係氫或 C_1-C_6 烷基且

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 (6)

其中取代基具有下列定義：

A 係 C_3-C_6 環烷基，其帶有 1 至 3 個選自鹵素與 C_1-C_3 烷基之取代基；

R^9 係 C_1-C_6 烷基或 C_2-C_6 烯基，其中這些基可部份或完全鹵化及/或可帶有 1 或 2 個下列基：

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 烷氧羰基、 C_3-C_6 環烷基及苯基，其中苯基可部份或完全鹵化及/或可帶有一至三個下列基：硝基、氰基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_3-C_6 環烷基或雜環基；

R^{10} ， R^{11} ， R^{12} 各為氫或分別具有任一 R^9 之定義；

n 係 0 或 1；

Y 係氰基或鹵基；

W 係苯基、萘基或雜芳基，其中這些基可帶有一至三個下列基：硝基、鹵素、氰基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_3-C_6 環烷基及 C_1-C_4 烷氧羰基，

R^{13} 係 C_6-C_{15} 雙環烷基或 C_7-C_{15} 雙環烯基，其中這些基可完全鹵化且若彼等未完全鹵化，這些基之二個碳原子與 C_3-C_5 亞烷基可形成 5 至 7 員飽和碳環及/或可帶有一或分別為二、三、四或五個下列基：氰基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基及芳基，其中芳基可部份或完全鹵化及/或可帶有一或分別帶有 2 或 3 個下列取代基：硝基、氰基、 C_1-C_4

(請先閱讀背面之注意事項再寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(7)

烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基及 C_1-C_4 烷硫基：

R^{14} ， R^{15} ， R^{16} 分別為氫，

C_1-C_8 烷基，其可部份或完全鹵化及/或可帶有一或二個下列基： C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_3-C_7 環烷基、 C_5-C_7 環烯基、其中該部份之環基可帶有一或分別二或三個鹵素原子、 C_1-C_3 烷基及/或 C_1-C_3 烷氧基與芳基，其中芳基可部份或完全鹵化及/或可帶有一或分別 2 或 3 個下列取代基：硝基、氰基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基及 C_1-C_4 烷硫基或

C_3-C_6 環烷基、 C_3-C_6 環烯基或雜環基，其中這些基可部份或完全鹵化及/或帶有一或分別二或三個下列基：氰基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_1-C_6 烷基基及 C_1-C_6 烷硫基：

Ar 係芳基或雜芳基，其中這些基可帶有一或分別二或三個下列基：鹵素、氰基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 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 烷氧羰基、芳基、芳氧基及雜芳基，其中此部份基之環可帶有一或分別二或三個下列取代基：鹵基、氰基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷氧羰基。

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殺真菌活性，尤其對抗稻米之真

(請先閱讀背面之注意事項再寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(8)

菌疾病。

吾等發現該標的可以申請專利範圍第1項所謂之混合物達成。

式I化合物係本身已知的且見述於文獻(WO 97/15552)。

式II及III之殺真菌劑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：EP 341,475，俗名：carpropamide(商品名：WIN[®]，來自Bayer)；

III：CAS RN 139 920-32-4，建議俗名：dichlocymet (Sumitomo之發展商品)；

化合物V及其製法亦見述於WO 97/35838。

化合物IV及其製法以如下更詳盡方式解釋：對應化合物見於較早專利申請案PCT/EP 98/01031或DE 19710618.8。

由於化合物I之C=C及C=N雙鍵，化合物I可產生呈E/Z異構物之混合物，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之順式異構物係有較佳活性(以相對於-CO₂R¹之-OCH₃或-CH₃基為主構型)。

由-C(R³)=NOCH₂-雙鍵來看，化合物I之順式異構物係有較佳活性(以相對於-OCH₂-基之R³基為主構型)。

五、發明說明(9)

有關化合物之生物活性，較佳者係其中 m 為 0 之式 I 化合物。

同樣地，較佳者係式 I 化合物，其中 R^1 係甲基。

此外，較佳者係化合物 I，其中 R^3 係氫、氰基、環丙基、甲基、乙基、1-甲乙基或 CF_3 。

另外，較佳者係化合物 I，其中 R^3 係甲基。

此外，較佳者係化合物 I，其中 R^3 係氰基。

另外，較佳者係化合物 I，其中 R^3 係環丙基。

此外，較佳者係化合物 I，其中 R^3 係 CF_3 。

另外，較佳者係化合物 I，其中 R^5 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 R^5 係甲基。

另外，較佳者係化合物 I，其中 R^5 係乙基。

另外，較佳者係化合物 I，其中 R^5 係異丙基。

此外，較佳者係化合物 I，其中 R^5 係環丙基。

此外，較佳者係化合物 I，其中 R^5 係 CF_3 。

另外，較佳者係化合物 I，其中 R^5 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 R^5 係未經取代或經取代吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、噻吩基或三嗪基。

另外，較佳者係化合物 I，其中 R^5 係未經取代或經取代呋喃基、噻吩基或吡咯基。

此外，較佳者係化合物 I，其中 R^5 係未經取代或經取代呋唑基、噻唑基、異呋唑基、異噻唑基、吡唑基或嘧唑基。

五、發明說明 (10)

此外，較佳者係化合物 I，其中 R^5 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 R^5 係苯基，其未經取代或帶有一或二個下列基：硝基、氰基、羥基、胺基、胺羰基、胺硫羰基、鹵素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 烷胺基、二- C_1 - C_4 烷胺基、 C_1 - C_4 烷磺醯基、 C_1 - C_4 烷氧羰基、 C_1 - C_4 烷胺羰基或二- C_1 - C_4 烷胺羰基。

另外，較佳者係化合物 I，其中 R^4 係氫、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 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 R^4 係 C_1 - C_6 烷基。

此外較佳化合物 I 揭示於 WO 97/15,552。

有關對抗有害真菌(如稻瘟菌)之殺真菌活性，最好給予環烷基烷羧醯胺 IV，其具有下列取代基，其中各情形之較佳者可見其自身或組合：

帶有 R^9 與 R^{10} 基之碳原子最好有 R 構形。

較佳者係環烷基烷羧醯胺 IV，其中 R^9 係甲基且 R^{10} 係甲基或氫；特佳為化合物 IV，其中 R^9 係甲基且 R^{10} 係氫。

另外，較佳者係式 IV 之環烷基烷羧醯胺，其中 W 係未經取代或經取代苯基，其特別在 2-位置或位置 2 與 4 取代。特較佳者係在苯環第 4 位置取代且較佳經氰基或甲氧基取代，較佳以甲基，更佳以鹵素取代，其中在此情形中，較佳係氫。

五、發明說明 (11)

此外，較佳者係環烷基烷羧醯胺 IV，其中 $n = 1$ 。取代基 R^3 及 R^4 較佳為 C_1 - C_4 烷基且特佳為甲基。亦較佳者係組合，其中二個取代基中任一者為氫，而另一者為 C_1 - C_4 烷基，且特佳為甲基。

另外，較佳者係 α -氯或 α -溴環烷基烷羧醯胺 IV ($Y =$ 溴或氯)。特佳為 α -氰基環烷基烷羧醯胺 IV ($Y =$ 氰基)。

最後，較佳者係式 IV 之環烷基烷羧醯胺，其中 A 係未經取代或經取代環丙基。特佳者係環丙基，帶有 1 至 3 個取代基選自氯及 C_1 - C_3 烷基，特佳為甲基。氯化環丙基最好帶二個氯原子，彼等係在環丙烷環上鄰位位置。烷化或較佳甲基化環丙基最好在其中連接環丙烷環至分子其它部份之位置上的碳原子帶有任一個烷(甲基)取代基。

有關其用途，特佳係化合物 I，其列於下表 1 至 13。

表 1

式 IVa 之羧醯胺 IVa.001 至 IVa.108

(* = 標記 "*" 之原子構形；R = R 構形；S = S 構形；rac. = 消旋)

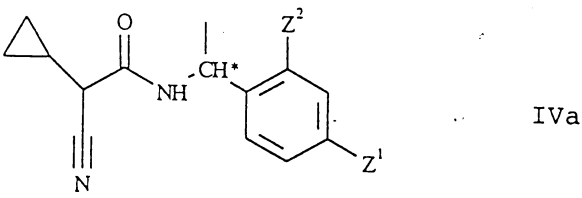
(請先閱讀背面之注意事項
填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (12)



No.	Z ¹	Z ²	*
IVa.001	H	H	R
IVa.002	H	H	S
IVa.003	H	H	rac.
IVa.004	H	Cl	R
IVa.005	H	Cl	S
IVa.006	H	Cl	rac.
IVa.007	H	CH ₃	R
IVa.008	H	CH ₃	S
IVa.009	H	CH ₃	rac.
IVa.010	H	OCH ₃	R
IVa.011	H	OCH ₃	S
IVa.012	H	OCH ₃	rac.
IVa.013	H	F	R
IVa.014	H	F	S
IVa.015	H	F	rac.
IVa.016	H	CN	R
IVa.017	H	CN	S
IVa.018	H	CN	rac.
IVa.019	Cl	H	R
IVa.020	Cl	H	S
IVa.021	Cl	H	rac.
IVa.022	Cl	Cl	R
IVa.023	Cl	Cl	S

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寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (13)

No.	Z ¹	Z ²	*
IVa.024	Cl	Cl	rac.
IVa.025	Cl	CH ₃	R
IVa.026	Cl	CH ₃	S
IVa.027	Cl	CH ₃	rac.
IVa.028	Cl	OCH ₃	R
IVa.029	Cl	OCH ₃	S
IVa.030	Cl	OCH ₃	rac.
IVa.031	Cl	F	R
IVa.032	Cl	F	S
IVa.033	Cl	F	rac.
IVa.034	Cl	CN	R
IVa.035	Cl	CN	S
IVa.036	Cl	CN	rac.
IVa.037	CH ₃	H	R
IVa.038	CH ₃	H	S
IVa.039	CH ₃	H	rac.
IVa.040	CH ₃	Cl	R
IVa.041	CH ₃	Cl	S
IVa.042	CH ₃	Cl	rac.
IVa.043	CH ₃	CH ₃	R
IVa.044	CH ₃	CH ₃	S
IVa.045	CH ₃	CH ₃	rac.
IVa.046	CH ₃	OCH ₃	R
IVa.047	CH ₃	OCH ₃	S
IVa.048	CH ₃	OCH ₃	rac.
IVa.049	CH ₃	F	R
IVa.050	CH ₃	F	S
IVa.051	CH ₃	F	rac.
IVa.052	CH ₃	CN	R
IVa.053	CH ₃	CN	S
IVa.054	CH ₃	CN	rac.
IVa.055	OCH ₃	H	R
IVa.056	OCH ₃	H	S

(請先閱讀背面之注意事項
填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (14)

No.	Z ¹	Z ²	*
IVa.057	OCH ₃	H	rac.
IVa.058	OCH ₃	Cl	R
IVa.059	OCH ₃	Cl	S
IVa.060	OCH ₃	Cl	rac.
IVa.061	OCH ₃	CH ₃	R
IVa.062	OCH ₃	CH ₃	S
IVa.063	OCH ₃	CH ₃	rac.
IVa.064	OCH ₃	OCH ₃	R
IVa.065	OCH ₃	OCH ₃	S
IVa.066	OCH ₃	OCH ₃	rac.
IVa.067	OCH ₃	F	R
IVa.068	OCH ₃	F	S
IVa.069	OCH ₃	F	rac.
IVa.070	OCH ₃	CN	R
IVa.071	OCH ₃	CN	S
IVa.072	OCH ₃	CN	rac.
IVa.073	F	H	R
IVa.074	F	H	S
IVa.075	F	H	rac.
IVa.076	F	Cl	R
IVa.077	F	Cl	S
IVa.078	F	Cl	rac.
IVa.079	F	CH ₃	R
IVa.080	F	CH ₃	S
IVa.081	F	CH ₃	rac.
IVa.082	F	OCH ₃	R
IVa.083	F	OCH ₃	S
IVa.084	F	OCH ₃	rac.
IVa.085	F	F	R
IVa.086	F	F	S
IVa.087	F	F	rac.

(請先閱讀背面之注意事項
填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (15)

No.	Z ¹	Z ²	*
IVa.088	F	CN	R
IVa.089	F	CN	S
IVa.090	F	CN	rac.
IVa.091	CN	H	R
IVa.092	CN	H	S
IVa.093	CN	H	rac.
IVa.094	CN	Cl	R
IVa.095	CN	Cl	S
IVa.096	CN	Cl	rac.
IVa.097	CN	CH ₃	R
IVa.098	CN	CH ₃	S
IVa.099	CN	CH ₃	rac.
IVa.100	CN	OCH ₃	R
IVa.101	CN	OCH ₃	S
IVa.102	CN	OCH ₃	rac.
IVa.103	CN	F	R
IVa.104	CN	F	S
IVa.105	CN	F	rac.
IVa.106	CN	CN	R
IVa.107	CN	CN	S
IVa.108	CN	CN	rac.

表 2

式 IVb 之羧醯胺 IVb.001 至 IVb.108，其中 Z¹，Z²及 "*" 組合之定義如表 1 各列所示。

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 (16)

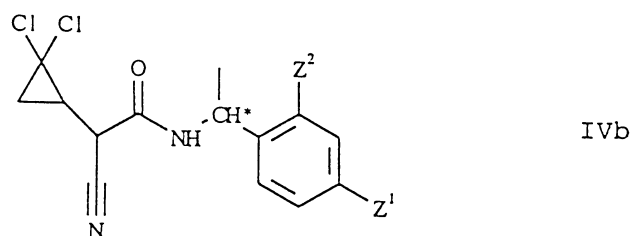


表 3

式 IVc 之羧醯胺 IVc.001 至 IVc.108，其中 Z^1 ， Z^2 及 "*" 組合之定義如表 1 各列所示。

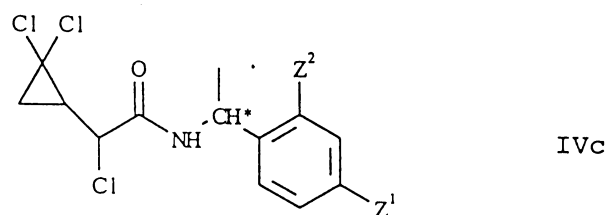


表 4

式 IVd 之羧醯胺 IVd.001 至 IVb.108，其中 Z^1 ， Z^2 及 "*" 組合之定義如表 1 各列所示。

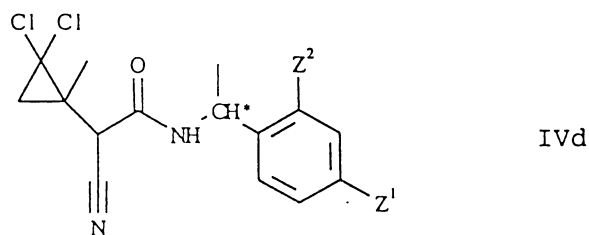


表 5

式 IVe 之羧醯胺 IVe.001 至 IVe.108，其中 Z^1 ， Z^2 及 "*" 組合之定義如表 1 各列所示。

五、發明說明(17)

組合之定義如表 1 各列所示。

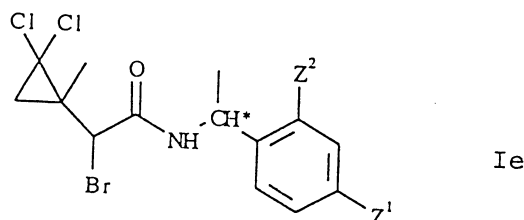


表 6

式 IVf 之羧醯胺 IVf.001 至 IVf.108，其中 Z^1 ， Z^2 及 "*" 組合之定義如表 1 各列所示。

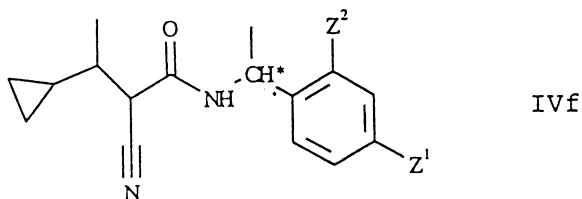


表 7

式 IVg 之羧醯胺 IVg.001 至 IVg.108，其中 Z^1 ， Z^2 及 "*" 組合之定義如表 1 各列所示。

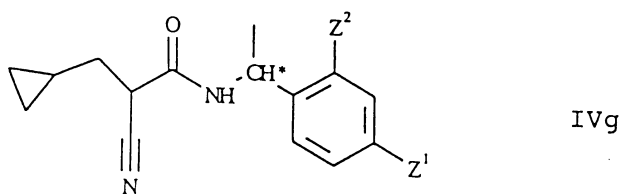


表 8

式 IVh 之羧醯胺 IVh.001 至 IVh.108，其中 Z^1 ， Z^2 及 "*" 組合之定義如表 1 各列所示。

五、發明說明(18)

組合之定義如表 1 各列所示。

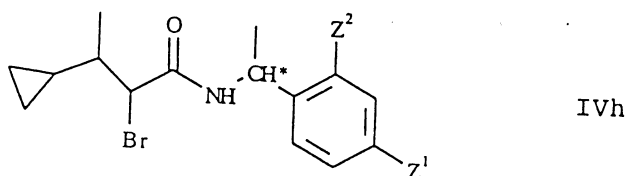


表 9

式 IVi 之羧醯胺 IVi.001 至 IVi.108，其中 Z^1 ， Z^2 及 "*" 組合之定義如表 1 各列所示。

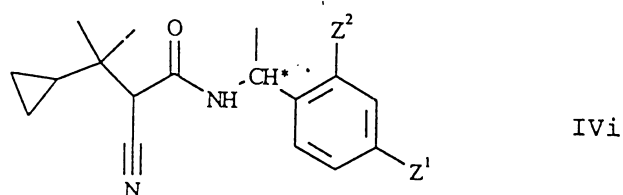


表 10

式 IVk 之羧醯胺 IVk.001 至 IVk.108，其中 Z^1 ， Z^2 及 "*" 組合之定義如表 1 各列所示。

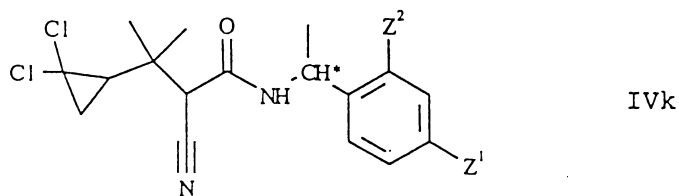


表 11

式 IVm 之羧醯胺 IVm.001 至 IVm.108，其中 Z^1 ， Z^2 及 "*" 組合之定義如表 1 各列所示。

五、發明說明 (19)

組合之定義如表 1 各列所示。

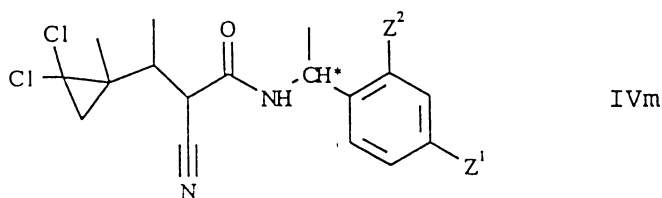


表 12

式 IVn 之羧醯胺 IVn.001 至 IVn.108，其中 Z^1 ， Z^2 及 "*" 組合之定義如表 1 各列所示。

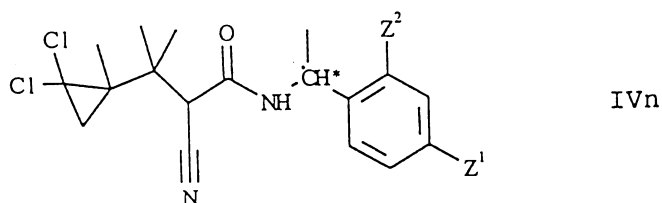
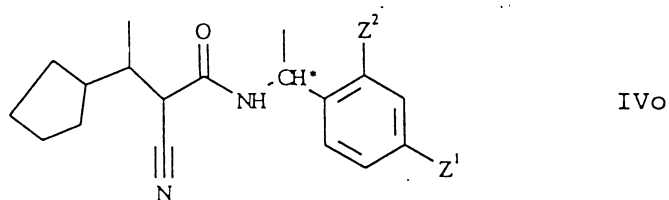


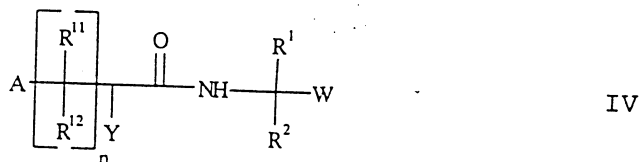
表 13

式 IVo 之羧醯胺 IVo.001 至 IVo.108，其中 Z^1 ， Z^2 及 "*" 組合之定義如表 1 各列所示。



另外，吾等已發現可產製良好產率羧醯胺 IV 之方法。
在較佳方法中，羧醯胺 IV

五、發明說明(20)



係以羧酸衍生物 VI



與式 VII 之胺反應而獲得



依文獻已知方法進行醯胺形成。式 VI' 之自由態羧酸(其中 Z 係羥基)通常先轉變成活化羧酸衍生物 VI(其中 Z 係如氣)。

羧酸 VI' 之活化最好用羧酸 VI' 直接加例如二環己基碳化二醯亞胺、氯甲酸乙酯、氰基膦酸二乙酯、三苯基膦/偶氮羧酸酯、2-吡啶 2-硫化物/三苯基膦、羰基二咪唑、硫醯氯、三氯化磷、五氯化磷等在原位中進行。通常，例如以羧酸 VI' 為主等莫耳量加入碳化二醯亞胺。

經由醯基氰化物活化羧酸係如以羧酸 VI' 與氰基膦酸二乙酯反應，最好於惰性溶劑如四氫呋喃、甲苯或二氯甲烷

(請先閱讀背面之注意事項
填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (21)

中進行(參考 Tetrahedron Lett. 18 (1973), 1595-8)。

經由酐之活化，例如以羧酸 VI' 與氯甲酸酯(如氯甲酸乙酯)反應，通常在鹼存在下，且若合宜於惰性溶劑，如甲苯或甲氫呋喃中進行(參考 "Houben-Weyl", 第 4 版, (1974), 15/1, 28-32 頁)。

鹽胺形成最好係在鹼如三級胺(例如三乙胺或二甲環己基胺)、鹼金屬碳酸鹽、鹼金屬氫氧化物、吡啶等進行。起始物及輔助鹼便利用等莫耳量。在某些情形中，稍過量輔助鹼 0.1 至 0.5 當量可能有利。

合宜溶劑係脂族烴(如己烷及 ligroin)、芳族烴(如甲苯與二甲苯)、氯化烴(如二氯甲烷及 1,2-二氯乙烷)、醚(如甲第三丁醚及四氫呋喃)、極性非質子溶劑(如乙腈與二甲基甲鹽胺)或酯(如乙酸乙酯)，或彼等混合物。

羧酸衍生物 VI 對胺 VII 之莫耳比通常為 0.8 至 1.5 且最好為 0.9 至 1.1。

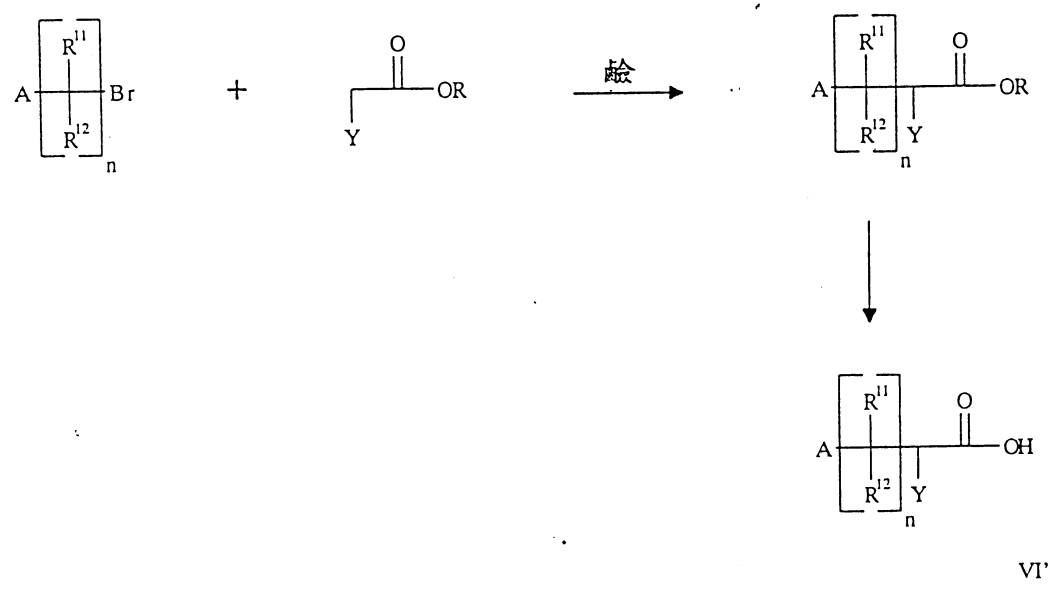
待反應完全後，如尋常操作，例如將反應混合物引入水中，接著萃取鹽胺。

式 VII 之胺係已知或可輕易獲得(cf. Organikum (1993) Barth Verlagsgesellschaft mbH Leipzig, p. 509 ff.; Indian J. Chem. 10 (1972), 366)。

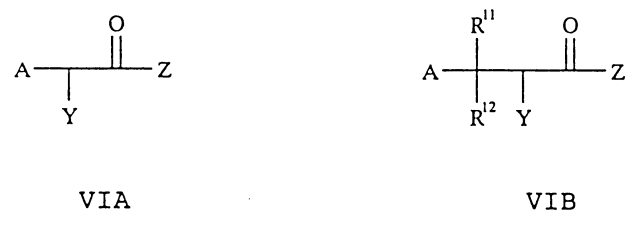
α -氯基環丙烷乙酸之製備見述於 Org. Prep. Proced. Int. 5 (1973), 25-29。流程圖 1 顯示構建式 VI' 之羧酸之一般路徑(cf. Collect. Czech. Chem. Commun. 48 (1983), 1597-1601 及 J. Polym. Sci., Polym. Chem. Ed. 14 (1976), 2357-9)。

五、發明說明 (22)

流程圖 1



式 VIA 之羧酸衍生物可進一步以流程圖 2 製備。



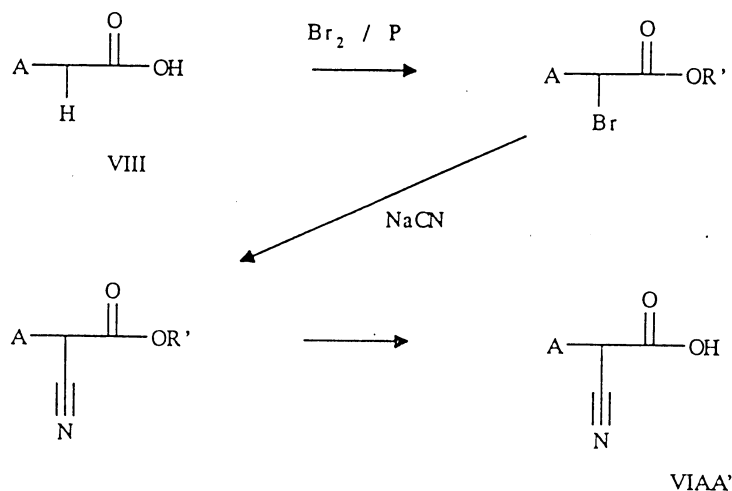
(請先閱讀背面之注意事項填寫本頁)

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(23)

流程圖 2



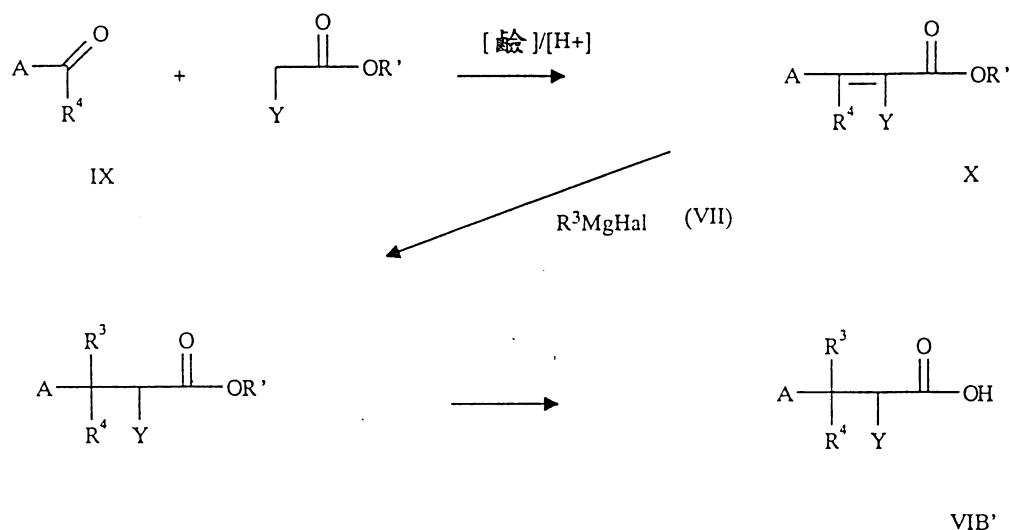
式 VIII 之環烷基乙酸(其中 A 如申請專利範圍第 1 項之定義)係已知(J. Chem. Technol. Biotechnol., Chem. Technol., 33A (1983), 109-15 ; NL 65 06 881 ; Chem. Ber. 41 (1908), 2627 ; Chem. Ber. 35 (1902), 2688)。

環烷基乙酸 VIII 可在 α 位置上依 J. Am. Chem. Soc 70 (1948), 3626 之流程溴化之。在 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 醇存在下操作直接產生對應酯。如 Synth. Commun. 23 (1993), 2323-9 所述進行接續溴/氰基交換。以標準程序進行酯水解而產生羧酸 VIAA' (Organikum 1993 Barth Verlagsgesellschaft mbH, Leipzig, p. 431ff.)。

式 VIB 之羧酸衍生物可以例如流程圖 3 所示路徑獲得。

五、發明說明(24)

流程圖 3



式 IX 之起始物，醯基-或甲醯環基烷通常可得(參考，特別是 J. Chem. Soc., Perkin Trans. I, 6 (1994), 739-52)。彼等係以 Knoevenagel 反應與 C₁-C₆ 烷基 α-鹵或 α-氰基乙酸酯作用而產生 Michael 系統 X(參考 Heterocycl. Compd. 24 (1988), 860-4)。

縮合通常係在與水不互溶之溶劑(如己烷、甲苯或二甲苯)中進行，移除反應期間形成水。末了，煮沸迴流加熱反應混合物數小時。

鹼(如六氫吡啶、吡啶、氨水或 β-丙胺酸)在酸(如冰醋酸)存在下視為催化劑。

式 XI 之烷基格仁亞(Grignard)試劑(其中 R³ 係如申請專利範圍第 1 項之定義且 Hal 係氯、溴或碘)接著加至式 X 之 Michael 系統而產生 VIB 型之飽和系統。

五、發明說明 (25)

反應係在惰性溶劑反應條件下進行。特佳者係醚(如四氫呋喃、乙醚、二甲氧乙烷或甲基第三丁醚)。反應溫度通常定在 -10 至 80°C 而較佳係 10 至 60°C 。

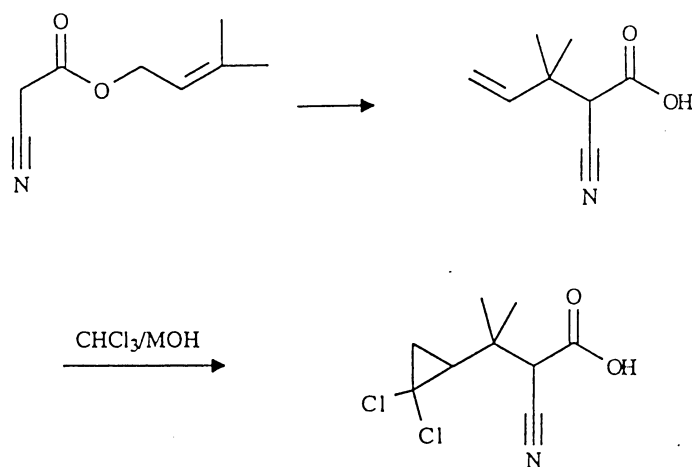
格仁亞試劑 XI 通常以 Michael 系統 X 為主用等莫耳量。在某些情形中，證實使用過量 0.2 至 0.5 莫耳當量之格仁亞試劑。

一般，加成作用係以銅，藉加入 1 至 10 莫耳酚化(例如碘化銅(I))催化進行。此結果 $1,2$ -加成作用比 $1,4$ -加成作用有更高選擇性。

自由態羧酸 VIB' 以對應酯之鹼性水解作用而製備 (Organikum 1993 Barth Verlagsgesellschaft mbH, Leipzig, p. 431ff.)。

對 2-氰基-3-(2,2-二氯環丙基)-3-甲基丁酸之良好路徑如流程圖 4 所示。

流程圖 4



五、發明說明 (26)

由氰基乙酸之 3-甲丁-2-烯酯製備 2-氰基-3,3-二甲戊-4-烯酸見述於 DE 26 49 711 及 Res. Discl. 249 (1985), 55。藉加入二氯卡巴烯(dichlorocarbene, 其以標準方法得自氯仿及鹼金屬氫氧化物)可直接得到 2-氰基-3-(2,2-二氯環丙基)-3-甲基丁酸。為增加產率, 在環丙烷化步驟前先保護羧酸基(例如轉化成第三丁酯)。

藉上述方法, 羧酸衍生物 VI 可依例如本發明製備羧醯胺 IV 之方法合宜獲得。相對於取代基 R^{11} 、 R^{12} 、A 及 Y 之羧酸衍生物 VI 之特佳具體實施例對應於羧醯胺 IV 之具體實施例。

Z 係親核取代基, 如羥基、 C_1 - C_4 烷氧基、鹵基(例如溴或氯)、雜芳基(例如咪唑基或吡啶基)、羧酸根(例如乙酸根或三氟乙酸根)等。

特佳者係式 VI 之羧酸衍生物, 其中 n 係 1 及/或 A 係未經取代或經取代環丙基。在 n 為 0 之情形中, 較佳者係式 VIA 之羧酸衍生物, 其中 A 係環丙基, 其可帶有 1 至 3 個取代基, 如氯及/或 C_1 - C_3 烷基。氯化環丙基最好在環丙環之孿位上帶有二個氯原子。

化合物 V 可由對應羧酸 XIIa 開始



以藉與胺 XIII 反應而製備(參考文獻 "Houben-Weyl" 係以 Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, 第 4 版, Thieme Verlag, Stuttgart 為主)。

五、發明說明(27)

羧酸 XIIa 係由 EP-A 653 418 中為已知的。

胺 XIII 通常亦為已知的或以已知方法獲得(參考 WO-A 95/23 784)。

反應最好以開始將羧酸 XIIa 轉成羧基活化衍生物 XII，特別轉成醯基鹵化物-例如氯化物，醯基氰化物或酐(參考 Tetrahedron Letters，第 18 卷，1595 至 1598 頁(1973)或 "Houben-Weyl"，第 15/1 卷，28 至 32 頁)。然後在鹼存在下用胺 XIII 反應這些衍生物 XII。

製備醯基氰化物，例如羧酸 XIIa 與氰基膦酸二乙酯，特別於惰性溶劑(如四氫呋喃、甲苯或二氯甲烷)中反應。

製備羧基活化酐，最好係用氯甲酸酯(如氯甲酸異丁酯)與羧酸 XIIa 於鹼及若合宜於惰性溶劑(如甲苯或四氫呋喃)中反應。

胺 XIII 與羧基活化羧酸 XII 反應最好係在溶劑(如二氯甲烷、四氫呋喃或甲苯)中進行。

胺 XIII 本身亦可作為鹼且彼等常由粗製物中收獲。

在此方法步驟之具體實施例中，羧酸 XIIa，胺 XIII，製備胺甲醯基羧酸 XII 之羧酸活化衍生物及鹼於單槽步驟中反應，若合宜於惰性溶劑中進行。

以此方式所得反應混合係以習知方式操作而產生化合物 V，例如與水混合，分離各相且若合宜色析純化粗產物。所得某些終產物呈無色或稍棕色黏稠油體之形式，其在減壓與中等昇溫下可無揮發成份，若所得終產物為固體，亦可進行純化，例如以再結晶或浸提。

五、發明說明 (28)

視取代基之性質，式 V 之化合物可呈異構物混合之幾何及/或光學異構物。尤其，化合物 V 中碳原子帶有 R^3 與 R^4 基，依 IUPAC 命名法可有 R 或 S 構形。文中所述純異構物及異構物之混合物具有殺真菌活性。

在化合物 V 中，有關 R^{13} 基，該分子之剩餘部份可排列向外或向內形式。在此情形中此二種異構物及其混合物均有殺真菌活性。

有關其抗真菌之生物性作用，較佳者為化合物 V，其中帶有 R^{15} 及 R^{16} 之碳原子具有 R 構形。

此外，較佳者係化合物 V，其中 R^{15} 係氫且 R^{16} 係 C_1 - C_4 烷基，特別為甲基。

另外，較佳者係化合物 V，其中 Ar 係視需要取代苯基，其在 2 位置或 2 與 4 位置，特特係在 4 位置上被置代。4-位置上較佳單獨取代基係氰基，較佳為甲基且特佳為鹵素，最佳為氯。

此外，較佳者為化合物 V，其中 R^{13} 係未經取代或經取代雙環烷基，具有 6 至 10 個碳原子。

此外，較佳者係化合物 V，其中 R^{13} 係未經取代或經取代雙環烯基，具有 7 至 10 個碳原子。

有關其用途特佳者係 WO-A 97/35838 表 1 所列之化合物。

於開始之化合物 I，IV 及 V 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

(請先閱讀背面之注意事項
填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (29)

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，如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氯氟甲基、1-氟乙基、2-氯乙基、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；

C_1 - C_4 烷氧基及 C_1 - C_4 烷氧羰基之烷氧基部份：甲氧基、乙氧基、丙氧基、1-甲乙氧基、丁氧基、1-甲丙氧基、2-甲丙氧基及1,1-二甲乙氧基；

C_1 - C_4 鹵烷氧基：如上所述 C_1 - C_4 烷氧基，其部份或完全被氟、氯、溴及/或碘取代，即，例如氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯二氟甲氧基、溴二氟甲氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2-溴甲氧基、2-碘乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-

(請先閱讀背面之注意事項
填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (30)

二氟乙氧基、2,2-二氟-2-氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、五氟乙氧基、2-氟丙氧基、3-氟丙氧基、2-氯丙氧基、3-氯丙氧基、2-溴丙氧基、3-溴丙氧基、2,2-二氟丙氧基、2,3-二氟丙氧基、2,3-二氯丙氧基、3,3,3-三氟丙氧基、3,3,3-三氯丙氧基、2,2,3,3,3-五氟丙氧基、七氟丙氧基、1-(氟甲基)-2-氟乙氧基、1-(氯甲基)-2-氯乙氧基、1-(溴甲基)-2-溴乙氧基、4-氟丁氧基、4-氯丁氧基、4-溴丁氧基及九氟丁氧基；

環烷基：3至6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有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C₂-C₆-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-1-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-戊烯基、4-甲基-2-戊烯基

五、發明說明(31)

、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C₂-C₆-炔基如乙炔基、2-丙炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、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、1,1-二甲基-2-丙炔基、1-乙基-2-丙炔基、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-4-戊炔基、4-甲基-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、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

(請先閱讀背面之注意事項
填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (32)

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，2-四氫噻吩基，3-四氫噻吩基，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-噻唑啉基，4-噻唑啉基，5-噻唑啉基，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，2,3-二氫噻吩-2-基，2,3-二氫噻吩-3-基，2,3-二氫噻吩-4-基，2,3-二氫噻吩-5-基，2,5-二氫噻吩-2-基，2,5-二氫噻吩-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，2,5-二氫吡咯-3-基，2,3-二氫異噁唑-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-

(請先閱讀背面之注意事項
填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (33)

二氫異噻唑-5-基，2,3-二氫異吡唑-3-基，2,3-二氫異吡唑-4-基，2,3-二氫異吡唑-5-基，4,5-二氫異吡唑-3-基，4,5-二氫異吡唑-4-基，4,5-二氫異吡唑-5-基，2,5-二氫異吡唑-3-基，2,5-二氫異吡唑-4-基，2,5-二氫異吡唑-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-4-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，2-四氫哌喃基，1,3-二氧戊烷-2-基，3,4,5,6-四氫吡啶-2-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1,3-二噻-2-基；

芳基或芳氧基，芳硫基，芳羰基和芳磺醯基：芳族環或多環氫基，其直接或經由氧原子(-O-)(芳氧基)或硫原子

(請先閱讀背面之注意事項
填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (34)

(-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等；

雜芳基或雜芳氧基，雜芳硫基，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 5-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-吡唑基，4-吡唑基，5-吡唑基，2-咪唑基，4-咪唑基，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 個硫或氧原子或 1 個氧或硫原子為環員，例如 2-呋喃基、3-呋喃基、2-噻喃基、3-噻喃基、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-

五、發明說明 (35)

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 個氧或硫原子之苯并稠合 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 個氮原子之苯并稠合 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-噻吡基、4-噻吡基、2-噻吡基、4-噻吡基、5-噻吡基、2-吡嗪基、1,3,5-三吡-2-基、1,2,4-三吡-3-基及 1,2,4,5-四吡-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、喹唑啉及喹啶啉，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 1 至 4 個氮原子或含 1 至 3 個氮原子與 1 個氧或 1 個硫原子，

(請先閱讀背面之注意事項
填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (36)

且係直接地鍵結到主鏈上者。

雙環烷基：具有 6 至 15 個碳環員之雙環烷基，例如，雙環[2.1.1]己-5-基、雙環[2.2.1]庚-2-基、雙環[2.2.2]辛-2-基、雙環[3.2.1]辛-6-基、雙環[3.2.2]壬-6-基、雙環[4.2.2]癸-7-基、雙環[3.1.0]己-1-基、雙環[4.1.0]庚-7-基、雙環[4.3.0]壬-1-基、雙環[4.4.0]癸-1-基，特佳 5-甲雙環[2.1.1]己-5-基、2-甲雙環[2.2.1]庚-2-基、2-甲雙環[2.2.2]辛-2-基、6-甲雙環[3.2.1]辛-6-基、6-甲雙環[3.2.2]壬-6-基、7-甲雙環[4.2.2]癸-7-基、1-甲雙環[3.1.0]己-1-基、1-甲雙環[4.1.0]庚-1-基、1-甲雙環[4.3.0]壬-1-基、1-甲雙環[4.4.0]癸-1-基、2-甲雙環[3.1.0]己-1-基、2-甲雙環[4.1.0]庚-1-基、2-甲雙環[4.3.0]壬-1-基、2-甲雙環[4.4.0]庚-1-基、金剛烷基；

雙環烯基：具有 7 至 15 個碳環員之雙環烯基，例如雙環[2.2.1]庚-2-烯-5-基、雙環[2.2.2]辛-2-烯-5-基、雙環[4.2.2]癸-7-烯-2-基、雙環[4.3.0]壬-7-烯-1-基、雙環[4.4.0]癸-3-烯-1-基、雙環[4.1.0]庚-3-烯-1-基、5-甲雙環[2.2.1]庚-2-烯-5-基、5-甲雙環[2.2.2]辛-2-烯-5-基、2-甲雙環[4.2.2]癸-7-烯-2-基、2-甲雙環[4.3.0]壬-7-烯-1-基、2-甲雙環[4.4.0]癸-3-烯-1-基、2-甲雙環[4.1.0]庚-3-烯-1-基；

亞烷基：具有 3 至 5 個碳原子之直鏈或分支亞烷基，例如 1,3-亞丙烷基、1,4-亞丁烷基、1-甲基-1,3-亞丙烷基、2-甲基-1,3-亞丙烷基、2,2-二甲基-1,3-亞丙烷基、1,5-亞戊烷基、1-甲基-1,4-亞丁烷基；

環烯基：具有 5 至 7 個碳環員且含一或多個雙鍵之單環烷

(請先閱讀背面之注意事項
填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (37)

基，例如 C_5-C_7 環烯基，例如環戊烯基、環己烯基及環庚烯基；

雜環基：3至6員飽和或部份未飽和單或多環雜環，其含1至3個選自氧、氮及硫之雜原子且其接至主鏈，例如2-四氫呋喃基，環氧乙烷基，3-四氫呋喃基，2-四氫噻吩基，3-四氫噻吩基，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-吡唑啉基，4-吡唑啉基，5-吡唑啉基，2-噁唑啉基，4-噁唑啉基，5-噁唑啉基，2-噻唑啉基，4-噻唑啉基，5-噻唑啉基，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，2,3-二氫噻吩-2-基，2,3-二氫噻吩-3-基，2,3-二氫噻吩-4-基，2,3-二氫噻吩-5-基，2,5-二氫噻吩-2-基，2,5-二氫噻吩-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，2,5-二氫吡咯-3-基，2,3-二氫異噁唑-2-基，2,3-二氫異噁唑-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，2,3-二氫異吡唑

(請先閱讀背面之注意事項
填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (38)

-3-基，2,3-二氫異吡唑-4-基，2,5-二氫異吡唑-5-基，4,5-二氫異吡唑-3-基，4,5-二氫異吡唑-4-基，4,5-二氫異吡唑-5-基，2,5-二氫異吡唑-3-基，2,5-二氫異吡唑-4-基，2,5-二氫異吡唑-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-4-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，2-四氫哌喃基，1,3-二氧戊烷-2-基，3,4,5,6-四氫吡啶-2-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1,3-二噻-2-基；

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

(請先閱讀背面之注意事項
填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (39)

當製備混合物中，最好用純活性成份 I 與 II 至 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 至 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、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。

彼等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*)，葡萄之葡萄鉤絲殼(*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*)(灰霉)，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

五、發明說明(40)

(*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 至 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。

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。

五、發明說明(41)

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

五、發明說明 (42)

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。

此配方通常包括自 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)。

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：

五、發明說明 (43)

- 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-單乙醇鹽胺之加成物、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合物；此粉塵包括 3 重量%活性成分；
- VII. 30 重量份活性成分、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

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (44)

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。

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：

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

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, 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

(請先閱讀背面之注意事項，填寫本頁)

裝

訂

線

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

用活性成份之水性製劑噴灑盆栽稻苗"台農 67"之葉片至濕答答爲止，該製劑係由含 10%活性成份，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劑接種植物。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。

CN(C)C(=O)C(=NOC)C1=CC=CC=C1COC2=C(C)C(=NOC)C(=NOC)C2

實驗結果見於下表 1 及 2：

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)

裝

訂

線

五、發明說明(46)

表 1 :

實例	活性成份	濃度呈 ppm	未處理對照組之功效%
1C	無	(100%疾病)	0
2C	化合物 I'	2.0 0.5	20 0
3C	化合物 II	2.0 0.5	20 0

表 2 :

實例	本發明之混合物(濃度呈 ppm)	觀察功效	計算功效*
4	2 ppm I'+2 ppm II	99	36
5	0.5 ppm I'+0.5 ppm II	25	0

*使用柯比程式計算者

實驗結果顯示所有混合比例之觀察功效均比使用柯比程式計算之效率高。

(請先閱讀背面之注意事項
填寫本頁)

裝

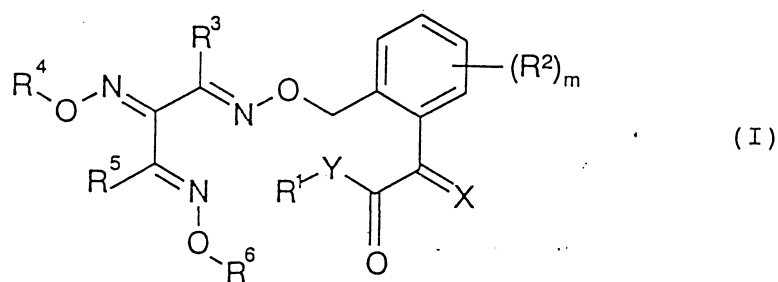
訂

線

四、中文發明摘要 (發明之名稱： 以叁(肟醚)衍生物及另外殺真菌劑為主之殺真菌混合物)

殺真菌混合物，包括呈協同活性量當作活性成份

a) 式 I 之苯乙酸衍生物



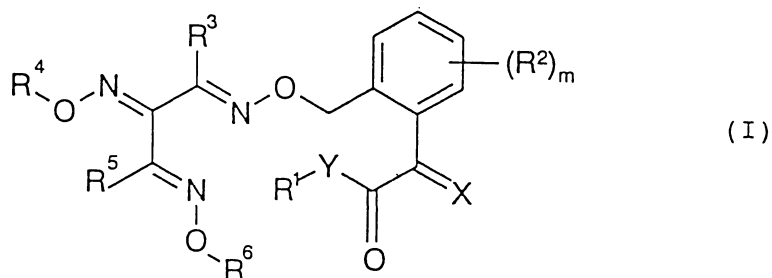
其中取代基及參數各如文中所述定義，及其鹽，及

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 FURTHER FUNGICIDES)

Fungicidal mixtures, comprising as active components

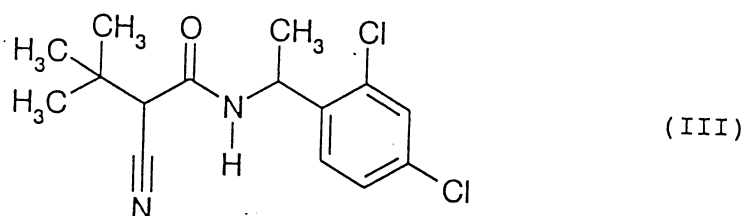
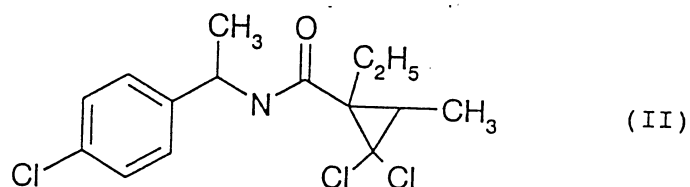
a) Phenylacetic acid derivatives of the formula i



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

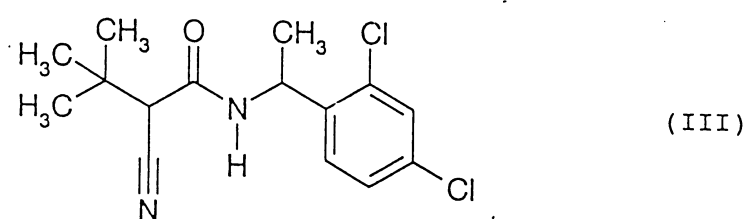
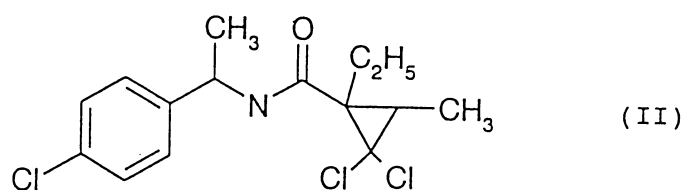
and

四、中文發明摘要 (發明之名稱：)



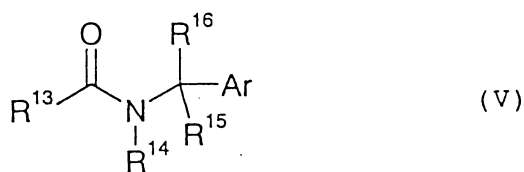
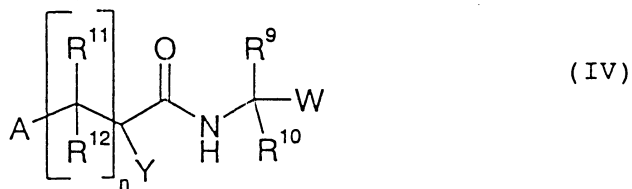
英文發明摘要 (發明之名稱：)

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



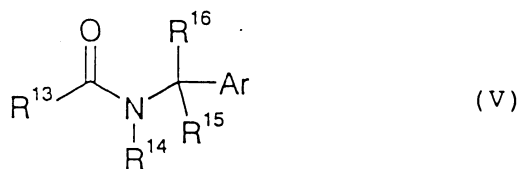
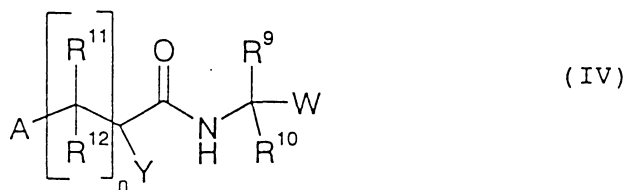
- 2a -

四、中文發明摘要 (發明之名稱:)



其中取代基如文中所述定義。

英文發明摘要 (發明之名稱:)



where the substituents are each as defined in the description, in a synergistically effective amount.

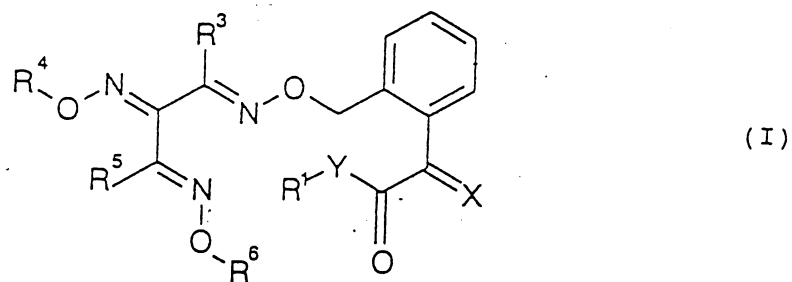
六、申請專利範圍

公 告 本

93. 1. 23

1. 一種殺真菌混合物，包括呈協同活性量當作活性成份之

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 ；

Y 係 NR ；

R^1, R 分別各為氫及 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基；

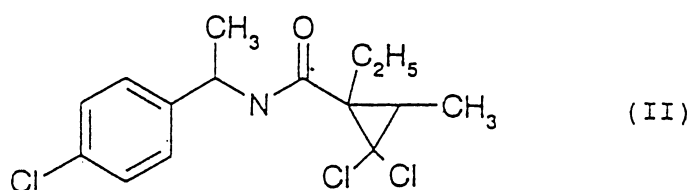
R^3 係 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基；

R^4, R^5 及 R^6 分別各為 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基；

及其鹽，

與

b) 一種式 II 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化合物 I，而另一部份包括於固體或液體載體中一種化合物 II。
3. 一種防治有害真菌之方法，包括以根據申請專利範圍第 1 至 2 項中任一項之殺真菌混合物處理真菌，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，其中化合物 I 及一種化合物 II 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/公頃之化合物 I 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/公頃之一種化合物 II 處理。