



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201201691 A1

(43)公開日：中華民國 101 (2012) 年 01 月 16 日

(21)申請案號：100103818

(22)申請日：中華民國 100 (2011) 年 02 月 01 日

(51)Int. Cl. : A01N43/58 (2006.01)

A01N43/08 (2006.01)

A01P3/00 (2006.01)

(30)優先權：2010/02/04 歐洲專利局

10152669.7

(71)申請人：先正達合夥公司 (瑞士) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (CH)

瑞士

(72)發明人：崔 史帝芬 TRAH, STEPHAN (DE) ; 藍伯斯 克萊門斯 LAMBERTH, CLEMENS (DE)

(74)代理人：閻啟泰；林景郁

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：13 項 圖式數：0 共 64 頁

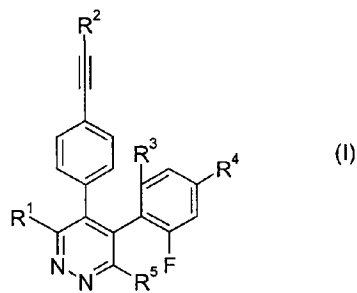
(54)名稱

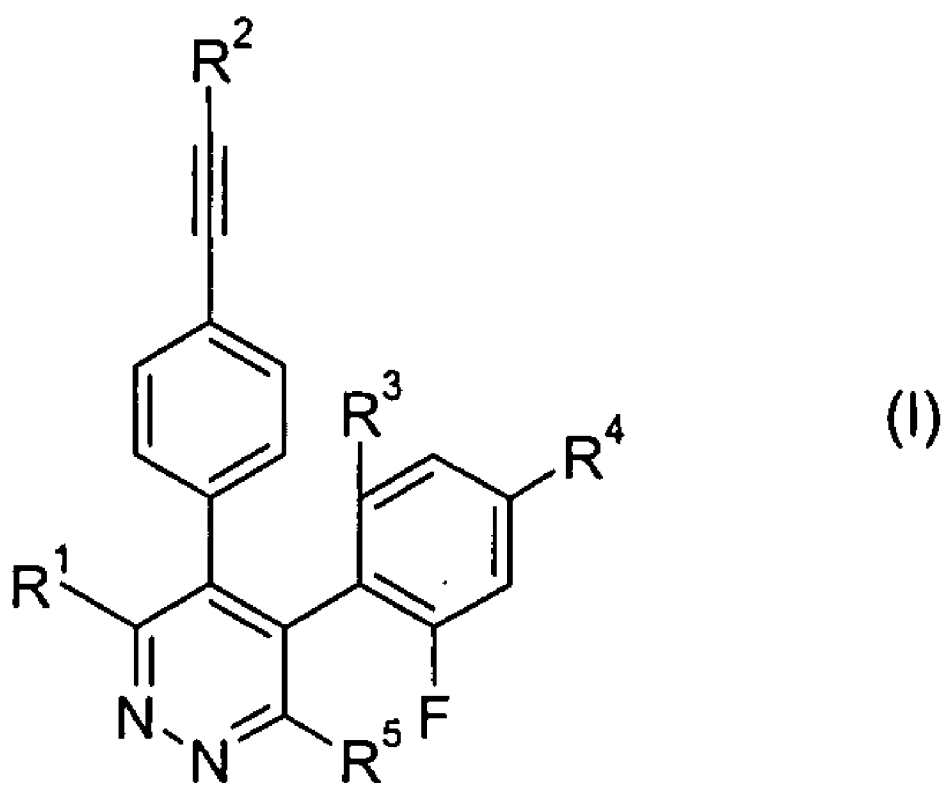
新穎化合物

NOVEL COMPOUNDS

(57)摘要

本發明係關於新穎的式(I)噻吩衍生物，其作為活性成份具有殺微生物活性，尤其殺真菌活性







(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201201691 A1

(43)公開日：中華民國 101 (2012) 年 01 月 16 日

(21)申請案號：100103818

(22)申請日：中華民國 100 (2011) 年 02 月 01 日

(51)Int. Cl. : A01N43/58 (2006.01)

A01N43/08 (2006.01)

A01P3/00 (2006.01)

(30)優先權：2010/02/04 歐洲專利局

10152669.7

(71)申請人：先正達合夥公司 (瑞士) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (CH)

瑞士

(72)發明人：崔 史帝芬 TRAH, STEPHAN (DE) ; 藍伯斯 克萊門斯 LAMBERTH, CLEMENS (DE)

(74)代理人：閻啟泰；林景郁

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：13 項 圖式數：0 共 64 頁

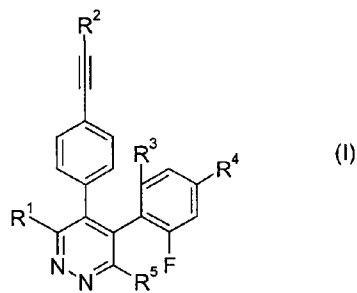
(54)名稱

新穎化合物

NOVEL COMPOUNDS

(57)摘要

本發明係關於新穎的式(I)噻吩衍生物，其作為活性成份具有殺微生物活性，尤其殺真菌活性



六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於具有殺微生物活性，尤其殺真菌活性之新穎嗒吡衍生物；製備其之方法及中間體；包含其之農業組成物；及在農業或園藝中使用該等化合物或組成物控制或預防植物病原性微生物（較佳為真菌）侵染植物、所收穫之糧食作物、種子或無生命物質之方法。

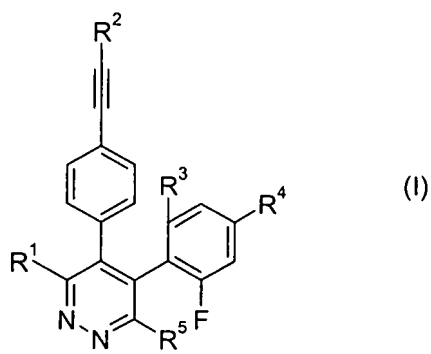
【先前技術】

具有殺真菌活性之嗒吡衍生物揭示於國際專利申請案 WO2005121104 、 WO2006001175 、 WO2007066601 、 WO2007080720 、 WO2008009405 、 WO2008009406 及 WO2008049585 中。需要控制真菌之替代性方法。新穎化合物較佳可具有改良之殺真菌特性，諸如改良之功效、改良之選擇性、產生抗性的傾向較低或抗較廣範圍真菌之活性。化合物可能更利於調配或提供在作用地點更有效遞送及保留，或可更易於生物降解。尤其需要具有改良之治療作用之殺真菌劑。

【發明內容】

已驚訝地發現本發明之嗒吡化合物展現出乎意料的殺真菌活性，包括出乎意料的治療活性，且因此適用於農業中作為作物保護劑抵抗或預防真菌侵染。

本發明提供一種式（I）化合物



其中

R^1 為甲基或乙基；

R^2 為 H 或氯；

R^3 為氟或氯；

R^4 為氟或甲氧基；且

R^5 為氯或甲氧基；

或其農用化學上可用之鹽形式。

本發明包括式 (I) 化合物之所有彼等可能的異構體形式及其混合物。舉例而言，由於圍繞單鍵旋轉受到限制，因此可存在滯轉異構體 (atropisomer)。

在一較佳具體實例中：

R^1 為甲基；

R^2 為 H 或氯；

R^3 為氟；

R^4 為氟或甲氧基；且

R^5 為氯或甲氧基。

在一更佳具體實例中：

R^1 為甲基；

R^2 為 H；

R^3 為 氟 ；

R^4 為 氟 或 甲 氧 基 ； 且

R^5 為 氟 。

較 佳 個 別 化 合 物 選 自 ：

3-氯-5-(4-乙炔基苯基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)嗒咩；

3-氯-4-(2,6-二氟-4-甲氧基苯基)-5-(4-乙炔基苯基)-6-甲基嗒咩；

4-(2,6-二氟-4-甲氧基苯基)-5-(4-乙炔基苯基)-3-甲氧基-6-甲基嗒咩；

4-(4-乙炔基苯基)-6-甲氧基-3-甲基-5-(2,4,6-三氟苯基)嗒咩；

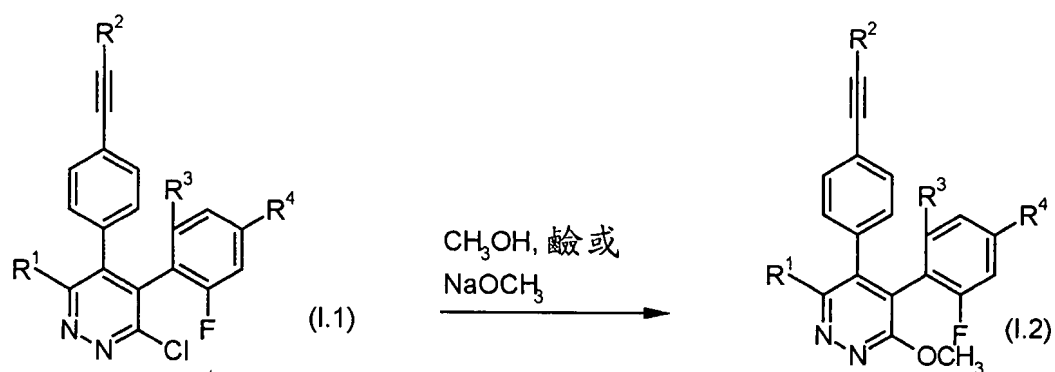
3-氯-5-(4-氯乙炔基苯基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)嗒咩；及

3-氯-5-(4-氯乙炔基苯基)-4-(2,6-二氟-4-甲氧基苯基)-6-甲基-嗒咩。

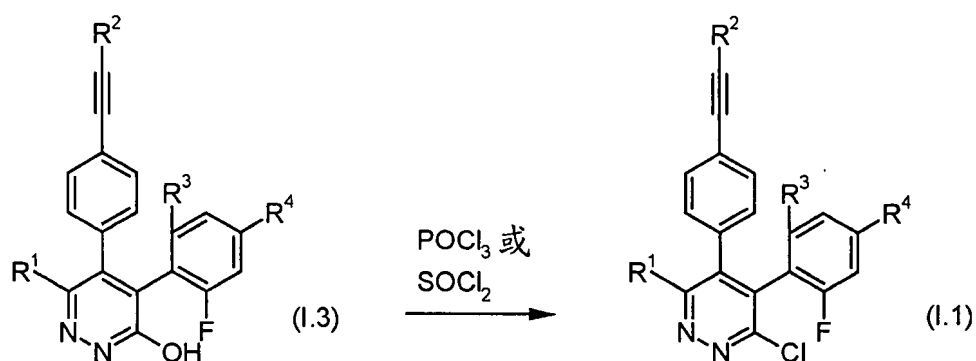
【 實 施 方 式 】

本發明之化合物可根據以下反應流程製備，其中除非另作說明，否則各變數 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 之定義係如上文式 (I) 化合物所定義。

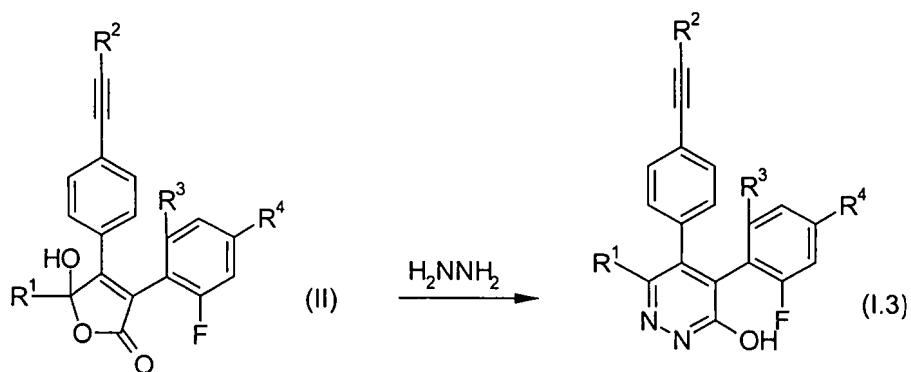
式 (I.2) 化合物可藉由用甲醇及鹼或用甲醇鈉轉化式 (I.1) 化合物來獲得。



式 (I.1) 化合物可藉由用氧氯化磷或亞硫酰氯轉化式 (I.3) 化合物來獲得。

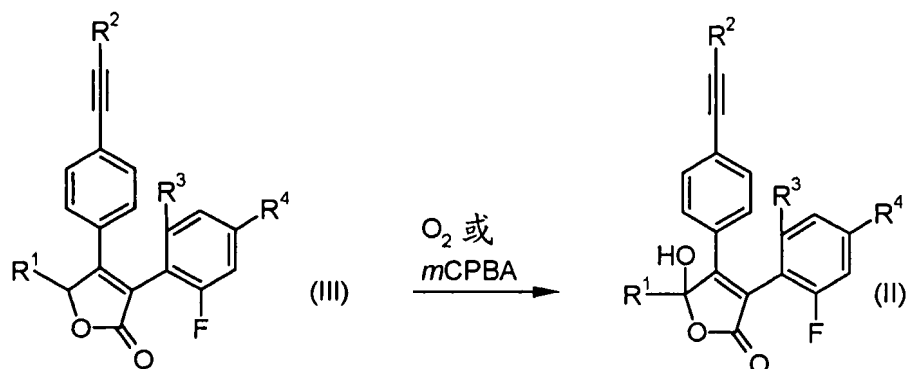


式 (I.3) 化合物可藉由用胼衍生物 (例如水合胼) 轉化式 (II) 化合物來獲得。

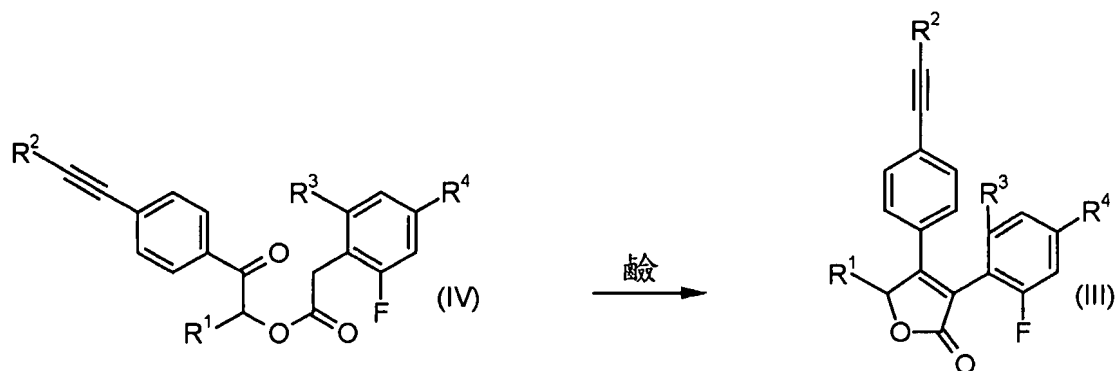


式 (II) 化合物可藉由用氧氣、空氣或 3-氯過苯甲酸氧

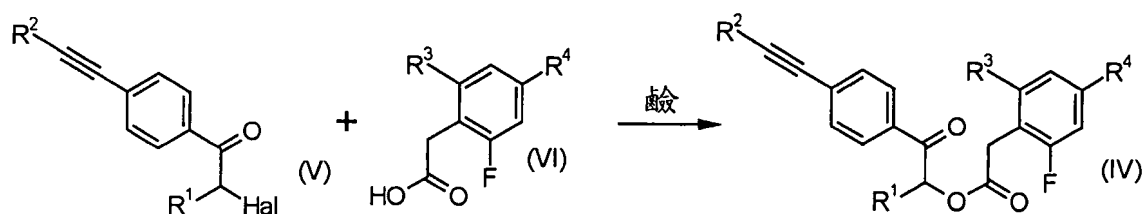
化轉化式 (III) 化合物來獲得。



式 (III) 化合物可藉由用鹼，例如吡啶、三乙胺、二異丙基乙胺、1,5-二氮雜雙環[4.3.0]壬-5-烯或 1,8-二氮雜雙環[5.4.0]十一-7-烯轉化式 (IV) 化合物 (其中 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 如式 (I) 所定義) 來獲得。



式 (IV) 化合物可藉由用式 (VI) 化合物及鹼，例如吡啶、三乙胺、二異丙基乙胺、1,5-二氮雜雙環[4.3.0]壬-5-烯或 1,8-二氮雜雙環[5.4.0]十一-7-烯轉化式 (V) 化合物 (其中 Hal 為鹵素，較佳為氯或溴) 來獲得。



式 (I.3)、(II)、(III) 及 (IV) 之化合物形成本發明之其他態樣。

式 (I) 化合物可以未修飾之形式使用或較佳與調配技術中習知使用之載劑及佐劑一起使用。

因此，本發明另外提供一種包含式 (I) 化合物及惰性載劑、用於控制及防止植物病原性微生物之組成物，及一種控制或預防植物病原性微生物侵染有用植物之方法，其中將包含式 (I) 化合物作為活性成份及惰性載劑之組成物施用於植物、其部分或其所在地。

另外，本發明可用於保護例如木材、牆板及塗料之無生命物質免遭真菌侵襲。

為此，式 (I) 化合物及惰性載劑適宜用已知方式調配為可軟化之濃縮物、可塗佈之糊狀物、可直接噴霧或可膨脹之溶液、稀乳液、可濕性粉劑、可溶性粉劑、撒粉、顆粒以及囊封於例如聚合物中。如同組成物類型一樣，根據預定目標及流行情況選擇施用方法，諸如噴霧、霧化、撒粉、散佈、塗佈或澆注。組成物亦可含有其他佐劑，諸如穩定劑、消泡劑、黏度調節劑、黏合劑或撫慰劑 (pacifier) 以及肥料、微量營養素供體或用於獲得特定效果的其他調配物。

合適載劑及佐劑可為固體或液體且為適用於調配技術之物質，例如天然或再生礦物質、溶劑、分散劑、濕潤劑、增黏劑、增稠劑、黏合劑或肥料。該等載劑例如描述於 WO199733890 中。

式 (I) 化合物或包含式 (I) 化合物作為活性成份及惰性載劑之組成物可與其他化合物同時或依序施用於植物所在地或欲處理之植物。此等其他化合物可為例如肥料或微量營養素供應體或影響植物生長之其他製劑。其亦可為選擇性除草劑、植物生長調節劑以及殺蟲劑、殺真菌劑、殺細菌劑、殺線蟲劑、殺軟體動物劑或若干此等製劑之混合物，若需要，則與調配技術中常用之其他載劑、界面活性劑或施用促進佐劑一起使用。

施用式 (I) 化合物或包含式 (I) 化合物作為活性成份及惰性載劑之組成物的較佳方法為葉面施用。施用頻率及施用量將取決於相應病原體侵染之風險。然而，式 (I) 化合物亦可藉由向植物所在地噴淋液體調配物或藉由將固體形式之化合物（例如顆粒形式）施用於土壤（土壤施用），經由土壤，透過根部滲入植物（內吸作用）。在水稻作物中，該等顆粒可施用於泛水之稻田中。式 (I) 化合物亦可藉由用殺真菌劑之液體調配物浸漬種子或塊莖或用固體調配物包覆而施用於種子（包覆）。

調配物（亦即包含式 (I) 化合物及固體或液體佐劑（若需要）之組成物）以已知方式製備，通常藉由將化合物與增量劑（例如溶劑、固體載劑及視情況選用之表面活性化

合物（界面活性劑）一起緊密混合及/或研磨來製備。

農用化學調配物通常含有 0.1 至 99 重量%，較佳 0.1 至 95 重量%式（I）化合物；99.9 至 1 重量%，較佳 99.8 至 5 重量%固體或液體佐劑及 0 至 25 重量%，較佳 0.1 至 25 重量%界面活性劑。

儘管調配呈濃縮物形式的商業產品較佳，但最終使用者通常使用稀釋的調配物。

有利施用量通常為每公頃（ha）5 g 至 2 kg 活性成份（a.i.），較佳 10 g 至 1 kg a.i./ha，最佳 20 g 至 600 g a.i./ha。當作為種子噴淋劑使用時，適宜施用量為每 kg 種子 10 mg 至 1 g 活性物質。可藉由實驗確定獲得所需作用之施用量。其取決於例如作用類型、有用植物之發育階段及施用（地點、時機、施用方法）且可由於此等參數而在大範圍內變化。

本發明係關於一種控制或預防植物病原性微生物侵染有用植物之方法，其中式（I）化合物作為活性成份施用於該等植物、其部分或其所在地。本發明之式（I）化合物的特點為低施用量下之優良活性、植物之良好耐受性及環境安全性。其具有極適用之治療、預防及內吸收特性且用於保護許多有用植物。式（I）化合物可用於抑制或消滅出現於許多不同有用植物之植物或植物之部分（果實、花、葉、莖、塊莖、根）上之疾病，同時亦保護以後生長的彼等植物之部分免遭例如植物病原性微生物侵染。

亦可使用式（I）化合物作為拌種劑（dressing agent）

處理植物繁殖材料，尤其種子（果實、塊莖、穀粒）及植物插枝（例如水稻），防止真菌感染以及抵抗土壤中存在之植物病原性真菌。

此外，本發明之式（I）化合物可用於在相關領域中控制真菌，例如用於保護工業材料，包括木材及與木材相關之工業產品；食物儲存或衛生管理。

在本發明之範疇內，欲保護之有用植物通常包含以下各類植物：穀類（小麥、大麥、裸麥、燕麥、水稻、玉米、高粱及相關物種）；甜菜（糖用甜菜及飼用甜菜）；仁果、核果及無核小果（蘋果、梨、李子、桃、杏仁、櫻桃、草莓、覆盆子及黑莓）；豆科植物（菜豆、扁豆、豌豆、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）；葫蘆科植物（南瓜、黃瓜、甜瓜）；纖維植物（棉花、亞麻、大麻、黃麻）；柑橘類水果（橙、檸檬、葡萄柚、桔子）；蔬菜（菠菜、萵苣、蘆筍、甘藍菜、胡蘿蔔、洋蔥、番茄、馬鈴薯、紅辣椒）；樟科（鱧梨、肉桂、樟腦）或諸如以下之植物：菸草、堅果、咖啡、茄子、甘蔗、茶葉、胡椒、藤本植物、乾蛇麻、香蕉及天然橡膠植物，以及觀賞植物。

術語「有用植物」及/或「目標作物」應理解為亦包括已由於習知育種或遺傳工程方法而耐受諸如溴苯腈之除草劑或各類除草劑（舉例而言諸如 HPPD 抑制劑、ALS 抑制劑（例如 氟嘧磺隆（primisulfuron）、氟磺隆（prosulfuron）及三氟啶磺隆（trifloxysulfuron））、EPSPS（5-烯醇-丙酮醯

基-莽草酸-3-磷酸合成酶) 抑制劑、GS (麩醯胺酸合成酶) 抑制劑或 PPO (原卟啉原氧化酶) 抑制劑) 之有用植物。已藉由習知育種方法 (突變誘發) 而耐受咪唑啉酮 (例如甲氧咪草菸 (imazamox)) 之作物之實例為 Clearfield® 夏季油菜 (芥花)。已藉由遺傳工程方法而耐受除草劑或各類除草劑之作物之實例包括以商標 RoundupReady®、Herculex I® 及 LibertyLink® 市售之具有草甘膦 (glyphosate) 及草銨膦 (glufosinate) 抗性之玉米品種。

術語「有用植物」及/或「目標作物」應理解為亦包括已藉由使用重組 DNA 技術轉型而能夠合成一或多種選擇性作用毒素 (諸如已知由例如毒素產生細菌、尤其芽胞桿菌屬細菌所產生之毒素) 之有用植物。

術語「有用植物」及/或「目標作物」應理解為亦包括已藉由使用重組 DNA 技術轉型而能夠合成具有選擇作用之抗病原物質 (諸如所謂的「病原性相關蛋白質」(PRP, 參見例如 EP-A-0 392 225)) 之有用植物。該等抗病原物質及能夠合成該等抗病原物質之轉殖基因植物的實例已知於例如 EP-A-0 392 225、WO 95/33818 及 EP-A-0 353 191 中。製備該等轉殖基因植物之方法通常為熟習此項技術者已知且描述於例如上述公開案中。

如本文所用之術語有用植物的「所在地」意欲包含有用植物正生長之地點、有用植物之植物繁殖材料之播撒地、或有用植物之植物繁殖材料之種植地。該所在地之實例為作物植物正生長之田地。

術語「植物繁殖材料」應理解為表示可用於繁殖植物之植物生殖部分，諸如種子；及營養性材料，諸如插枝或塊莖（例如馬鈴薯）。可提及例如植物之種子（嚴格意義上）、根、果實、塊莖、球莖、根莖及部分。亦可提及在萌芽後或露出土壤後移栽的萌芽植物及秧苗。此等秧苗可在移栽前藉由以浸漬方式全部或部分處理而加以保護。「植物繁殖材料」較佳應理解為表示種子。

式(I)化合物有效抵抗例如以下各類植物病原性真菌：不完全菌綱 (Fungi imperfecti) (例如鏈格孢屬 (*Alternaria* spp.))、擔子菌綱 (Basidiomycetes) (例如伏革菌屬 (*Corticium* spp.)、角擔菌屬 (*Ceratobasidium* spp.)、多核菌屬 (*Waitea* spp.)、亡革菌屬 (*Thanatephorus* spp.)、絲核菌屬 (*Rhizoctonia* spp.)、駝孢鏽菌屬 (*Hemileia* spp.)、柄鏽菌屬 (*Puccinia* spp.)、層鏽菌屬 (*Phakopsora* spp.)、黑穗病菌屬 (*Ustilago* spp.)、腥黑穗病菌屬 (*Tilletia* spp.))、子囊菌綱 (Ascomycetes) (例如黑星菌屬 (*Venturia* spp.)、布氏白粉菌屬 (*Blumeria* spp.)、白粉菌屬 (*Erysiphe* spp.)、叉絲單囊殼屬 (*Podosphaera* spp.)、鉤絲殼屬 (*Uncinula* spp.)、褐腐病菌屬 (*Monilinia* spp.)、核盤菌屬 (*Sclerotinia* spp.)、炭疽菌屬 (*Colletotrichum* spp.)、小叢殼屬 (*Glomerella* spp.)、鐮胞菌屬 (*Fusarium* spp.)、赤黴菌屬 (*Gibberella* spp.)、雪黴菌屬 (*Monographella* spp.)、暗球腔菌屬 (*Phaeosphaeria* spp.)、球腔菌屬 (*Mycosphaerella* spp.)、尾孢菌屬 (*Cercospora* spp.)、核腔

菌屬 (*Pyrenophora* spp.)、雲形病菌屬 (*Rhynchosporium* spp.)、稻瘟病菌屬 (*Magnaporthe* spp.)、囊殼菌屬 (*Gaeumannomyces* spp.)、眼點病菌屬 (*Oculimacula* spp.)、柱隔孢屬 (*Ramularia* spp.)、葡萄孢盤菌屬 (*Botryotinia* spp.))及卵菌綱 (Oomycetes)(例如疫黴菌屬 (*Phytophthora* spp.)、腐黴菌屬 (*Pythium* spp.)、單軸黴屬 (*Plasmopara* spp.)、霜黴菌屬 (*Peronospora* spp.)、假霜黴屬 (*Pseudoperonospora* spp.)、盤梗黴屬 (*Bremia* spp.))。已觀測到抗白粉病 (例如葡萄白粉菌 (*Uncinula necator*))、銹病 (例如柄鏽菌屬) 及葉斑病 (例如球腔菌屬) 之優異活性。此外，新穎的式 (I) 化合物有效抵抗植物病原性革蘭氏陰性及革蘭氏陽性細菌 (例如黃單胞菌屬 (*Xanthomonas* spp.)、假單胞菌屬 (*Pseudomonas* spp.)、解澱粉歐文氏菌 (*Erwinia amylovora*)、羅爾斯通氏菌屬 (*Ralstonia* spp.)) 及病毒 (例如菸草花葉病毒)。

在本發明之一較佳具體實例中，使用本發明之化合物及組成物抵抗真菌生物體小麥斑點病菌 (*Mycosphaerella graminicola*)。

式 (I) 化合物通常以殺真菌組成物形式用於控制或防止植物病原性微生物，該等殺真菌組成物包含呈自由形式或農用化學上適用之鹽形式的至少一種式 (I) 化合物或至少一種如上定義之較佳個別化合物作為活性成份，及至少一種上述佐劑。

該等用於控制或防止植物病原性微生物之殺真菌組成

物（包含呈自由形式或農用化學上適用之鹽形式的至少一種式（I）化合物或至少一種如上定義之較佳個別化合物作為活性成份及至少一種上述佐劑）可與其他殺真菌劑混合，在某些情況下產生出乎意料的協同活性。

本發明另外關於包含至少一種式 I 化合物及至少一種其他殺生物活性成份及視情況選用之其他成份的混合物。其他殺生物活性成份已知於例如「The Pesticide Manual」[The Pesticide Manual - A World Compendium; 第十三版(新版(2003 年 11 月 02 日)); 編輯: C. D. S. Tomlin; The British Crop Protection Council, ISBN-10: 1901396134; ISBN-13: 978-1901396133]或其電子版「e-Pesticide Manual V4.2」或網站 <http://www.alanwood.net/pesticides/>，或較佳為下列其他殺蟲劑之一。

化合物 TX 與另一活性成份（B）之以下混合物為較佳的。縮寫「TX」意謂式（I）化合物，「TX」較佳意謂「一種選自由本發明表 1 之化合物組成之群之化合物」，因此縮寫「TX」意謂由本發明之式（I）所涵蓋之化合物，「TX」較佳意謂至少一種選自化合物編號 1 至化合物編號 17 之 17 種化合物的化合物：

（B）

（B1）嗜毬果傘素（strobilurin）殺真菌劑+TX，

（B2）唑殺真菌劑+TX，

（B3）嗎啉殺真菌劑+TX，

（B4）苯胺基嘧啶殺真菌劑+TX，

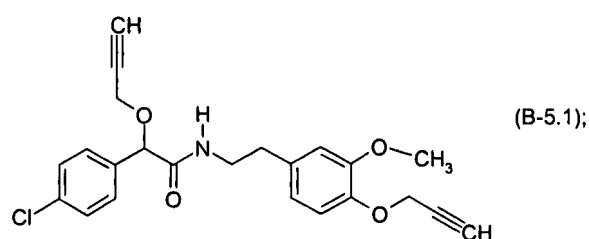
(B5) 選自由以下組成之群之殺真菌劑：

敵菌靈 (Anilazine) +TX、砷酸鹽 +TX、本達樂 (benalaxyl) +TX、右本達樂 (benalaxyl-M) +TX、麥鏽靈 (benodanil) +TX、免賴得 (benomyl) +TX、苯噻菌胺 (benthiavalicarb) +TX、異丙基苯噻菌胺 (benthiavalicarb-isopropyl) +TX、聯苯 +TX、比多農 (bitertanol) +TX、殺稻瘟菌素-S (blasticidin-S) +TX、波爾多液 (bordeaux mixture) +TX、白克列 (boscalid) +TX、布瑞莫 (bupirimate) +TX、氯化鋇 +TX、四氯丹 (captafol) +TX、蓋普丹 (captan) +TX、貝芬替 (carbendazim) +TX、二硫化碳 +TX、萎鏽靈 (carboxin) +TX、加普胺 (carpropamid) +TX、雪松葉油 (cedar leaf oil) +TX、螞離丹 (chinomethionat) +TX、氯 +TX、地茂散 (chloroneb) +TX、四氯異苯腈 (chlorothalonil) +TX、克氯得 (chlozolate) +TX、肉桂醛 (cinnamaldehyde) +TX、銅 +TX、碳酸銨銅 +TX、氫氧化銅 +TX、辛酸銅 +TX、油酸銅 +TX、硫酸銅 +TX、賽座滅 (cyazofamid) +TX、環己醯亞胺 (cycloheximide) +TX、克絕 (cymoxanil) +TX、益發靈 (dichlofluanid) +TX、大克隆 (dichlone) +TX、二氯丙烯 +TX、二氯西莫 (diclocymet) +TX、達滅淨 (diclomezine) +TX、氯硝胺 (dicloran) +TX、乙徽威 (diethofencarb) +TX、二氟林 (diflumetorim) +TX、二甲嘧吩 (dimethirimol) +TX、達滅芬 (dimethomorph) +TX、白粉克 (dinocap) +TX、腈硫醌 (dithianon) +TX、多寧 (dodine) +TX、護粒松 (edifenphos)

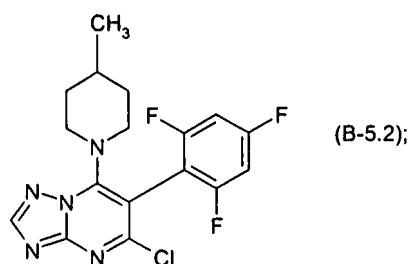
+TX、噻唑菌胺 (ethaboxam) +TX、依瑞莫 (ethirimol) +TX、
 依得利 (etridiazole) +TX、凡殺同 (famoxadone) +TX、
 咪唑菌酮 (fenamidone) +TX、敵克松 (fenaminosulf) +TX、
 芬滅松 (fenamiphos) +TX、芬瑞莫 (fenarimol) +TX、甲
 呋醯胺 (fenfuram) +TX、環醯菌胺 (fenhexamid) +TX、
 氟菌胺 (fenoxanil) +TX、拌種咯 (fempiclonil) +TX、三
 苯醋錫 (fentin acetate) +TX、三苯氯錫 (fentin chloride)
 +TX、三苯羥錫 (fentin hydroxide) +TX、福美鐵 (ferbam)
 +TX、富米綜 (ferimzone) +TX、扶吉胺 (fluazinam) +TX、
 護汰寧 (fludioxonil) +TX、氟硫滅 (flusulfamide) +TX、
 氟硫滅 +TX、福多寧 (flutolanil) +TX、福爾培 (folpet)
 +TX、甲醛 +TX、福賽得 (fosetyl-aluminium) +TX、熱必
 斯 (fthalide) +TX、麥穗靈 (fuberidazole) +TX、呋霜靈
 (furalaxyl) +TX、福拉比 (furametpyr) +TX、果綠定 (flyodin)
 +TX、富紫亭 (fuazatine) +TX、六氯苯 (hexachlorobenzene)
 +TX、殺紋寧 (hymexazole) +TX、克熱淨 (iminocadine)
 +TX、碘克浦 (iodocarb) +TX、丙基喜樂松 (ipobenfos)
 +TX、依普同 (iprodione) +TX、顛微威 (iprovalicarb) +TX、
 稻瘟靈 (isoprothiolane) +TX、春日黴素 (kasugamycin)
 +TX、鋅錳乃浦 (mancozeb) +TX、錳乃浦 (maneb) +TX、
 二 甲 基 二 硫 代 胺 基 甲 酸 亞 錳 (manganous
 dimethyldithiocarbamate) +TX、右滅達樂 (mefenoxam)
 +TX、滅普寧 (mepronil) +TX、氯化汞 +TX、汞 +TX、滅達
 樂 (metalaxyl) +TX、滅速克 (methasulfocarb) +TX、免

得爛 (metiram) +TX、滅芬農 (metrafenone) +TX、代森
 鈉 (nabam) +TX、印度楝樹油 (neem oil) (疏水性萃取物)
 +TX、尼瑞莫 (nuarimol) +TX、辛噻酮 (octhilinone) +TX、
 呋噻胺 (ofurace) +TX、歐殺斯 (oxadixyl) +TX、快得寧
 (oxine copper) +TX、歐索林酸 (oxolinic acid) +TX、嘉保
 信 (oxycarboxin) +TX、土黴素 (oxytetracycline) +TX、
 巴克素 (paclobutrazole) +TX、石蠟油 +TX、三聚甲醛 +TX、
 賓克隆 (pencycuron) +TX、五氯硝基苯 +TX、五氯苯酚 +TX、
 吡噻菌胺 (penthioopyrad) +TX、披扶座 (perfurazoate) +TX、
 磷酸 +TX、保粒黴素 (polyoxin) +TX、保粒黴素 D 鋅鹽 +TX、
 碳酸氫鉀 +TX、撲殺熱 (probenazole) +TX、撲滅寧
 (procymidone) +TX、霜黴威 (propamocarb) +TX、甲基鋅
 乃浦 (propineb) +TX、丙氧喹啉 (proquinazid) +TX、硫
 菌威 (prothiocarb) +TX、白粉松 (pyrazophos) +TX、比
 芬諾 (pyrifenox) +TX、百快隆 (pyroquilon) +TX、快諾
 芬 (quinoxifen) +TX、五氯硝基苯 (quintozene) +TX、矽
 硫芬 (silthiofam) +TX、碳酸氫鈉 +TX、二乙酸鈉 +TX、丙
 酸鈉 +TX、鏈黴素 (streptomycin) +TX、硫 +TX、TCMTB +TX、
 克枯爛 (tecloftalam) +TX、四氯硝基苯 (tecnazene) +TX、
 腐絕 (thiabendazole) +TX、賽氟滅 (thifluzamide) +TX、
 多保淨 (thiophanate) +TX、甲基多保淨 (thiophanate-methyl)
 +TX、得恩地 (thiram) +TX、脫克松 (tolclofos-methyl)
 +TX、甲基益發靈 (tolyfluand) +TX、咪唑吡 (triazoxide)
 +TX、哈茨木黴 (trichoderma harzianum) +TX、三賽唑

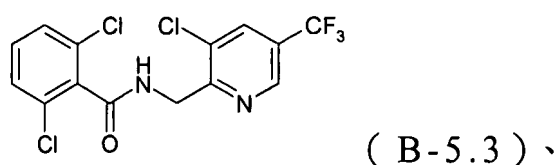
(tricyclazole) +TX、賽福寧 (triforine) +TX、氫氧化三苯錫 (triphenyltin hydroxide) +TX、維利黴素 (validamycin) +TX、免克寧 (vinclozolin) +TX、鋅乃浦 (zineb) +TX、益穗 (ziram) +TX、座賽胺 (zoxamide) +TX、1+TX, 1-雙(4-氯苯基)-2-乙氧基乙醇+TX、2+TX, 4-二氯苯基苯磺酸酯+TX、2-氟-N-甲基-N-1-萘基乙醯胺+TX、4-氯苯基苯磺+TX、式 B-5.1 化合物+TX



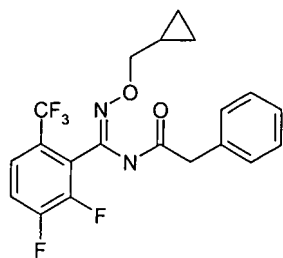
式 B-5.2 化合物+TX



式 B-5.3 化合物+TX

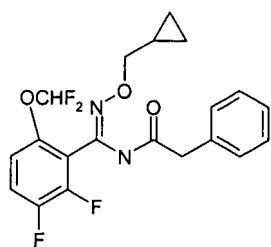


式 B-5.4 化合物 + TX



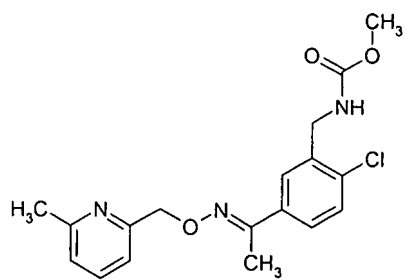
(B-5.4) 、

式 B-5.5 化合物 + TX



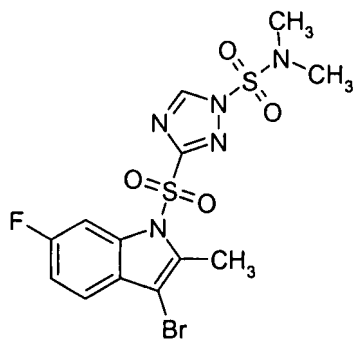
(B-5.5) 、

式 B-5.6 化合物 + TX



(B-5.6) 、

式 B-5.7 化合物 + TX



(5.7)、

3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸(2-二環丙基-2-基-苯基)-醯胺(化合物 B-5.8)+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸(9-異丙基-1,2,3,4-四氫-1,4-亞甲基-萘-5-基)-醯胺(化合物 B-5.9)+TX、1,3-二甲基-5-氟-1H-吡唑-4-甲酸[2-(1,3-二甲基丁基)苯基]-醯胺(化合物 B-5.10)+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸(3',4'-二氯-5-氟-1,1'-聯苯-2-基)-醯胺(化合物 B-5.11)+TX、N-{2-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]乙基}-2-(三氟甲基)苄醯胺(化合物 B-5.12)+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸 N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-醯胺(化合物 B-5.13)+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸 N-[2-(1,1,2,3,3,3-六氟丙氧基)苯基]-醯胺(化合物 B-5.14)、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸 N-[2-(2-氯-1+TX,1,2-三氟乙氧基)苯基]-醯胺(化合物 B-5.15)+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸 N-(4'-三氟甲基-聯苯-2-基)-醯胺(化合物 B-5.16)+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸 N-(2'-三氟甲基-聯苯-2-基)-醯胺(化合物 B-5.17)及 3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸 N-(2'-三氟甲基-聯苯-2-基)-醯胺(化合物 B-5.18)+TX；

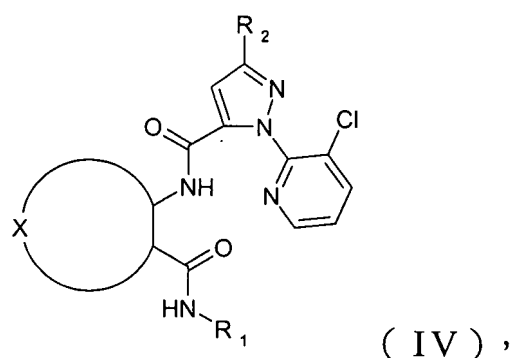
(B6) 選自由以下組成之群之植物生物調節劑：

酸化苯并噻二唑-S-甲酯 (acibenzolar-S-methyl) +TX、
矮壯素 (chlormequat chloride) +TX、益收生長素 (ethephon)
+TX、縮節胺 (mepiquat chloride) 及抗倒酯
(trinexapc-ethyl)；

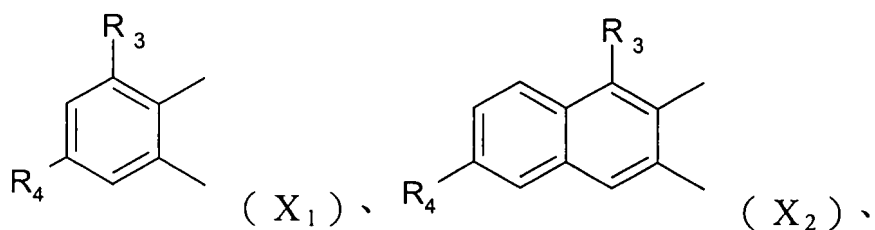
(B7) 選自由以下組成之群之殺蟲劑：

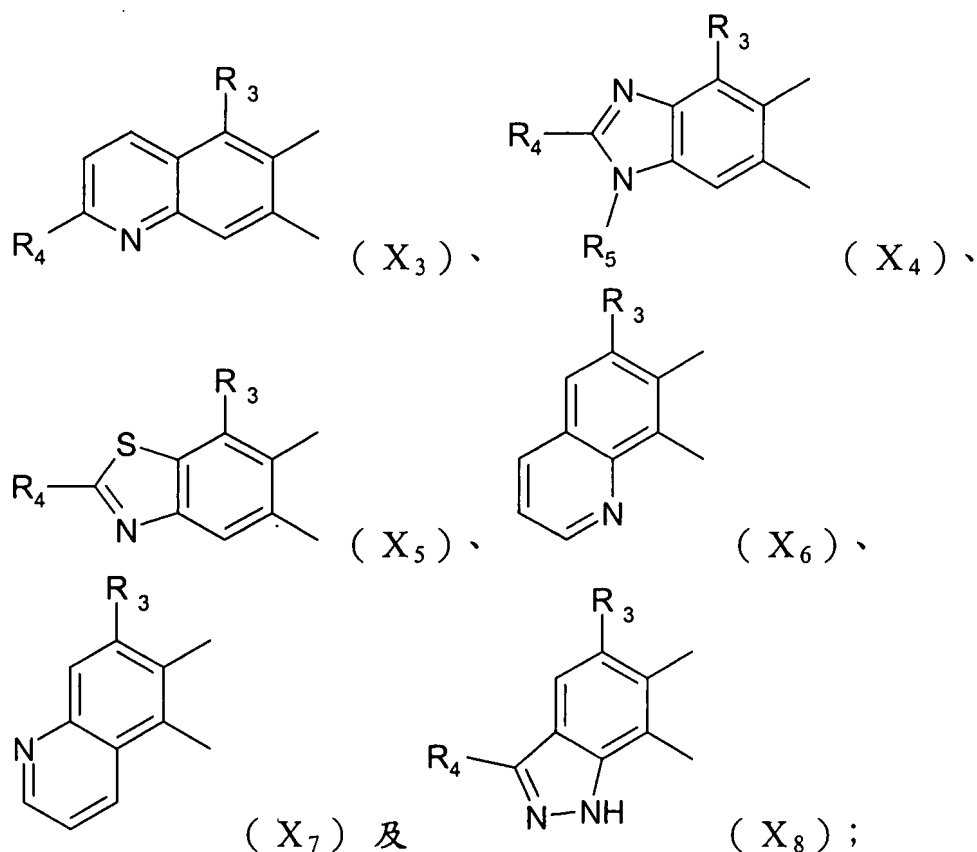
阿巴汀 (abamectin) +TX、可尼丁 (clothianidin) +TX、
因滅汀 (emamectin benzoate) +TX、益達胺 (imidacloprid)
+TX、七氟菊酯 (tefluthrin) +TX、噻蟲吡 (thiamethoxam)
+TX

及式 IV 化合物 +TX



其中 X 為選自以下之二價基團：





其中

a) R₁ 為在 1 位置經環丙基取代之環丙基，R₂ 為溴，R₃ 為甲基，R₄ 為 CN 且 X 為 X₁；

b) R₁ 為經環丙基取代之甲基，R₂ 為 CF₃，R₃ 為甲基，R₄ 為 Cl 且 X 為 X₁；

c) R₁ 為在 1 位置經環丙基取代之環丙基，R₂ 為 CF₃，R₃ 為甲基，R₄ 為 Cl 且 X 為 X₁；

d) R₁ 為在 1 位置經環丙基取代之環丙基，R₂ 為 CF₃，R₃ 為甲基，R₄ 為 CN 且 X 為 X₁；

e) R₁ 為在 1 位置經環丙基取代之環丙基，R₂ 為 OCH₂CF₃，R₃ 為甲基，R₄ 為 CN 且 X 為 X₁；

f) R₁ 為異丙基，R₂ 為甲氧基，R₃ 為甲基，R₄ 為氫且 X

為 X_8 ；

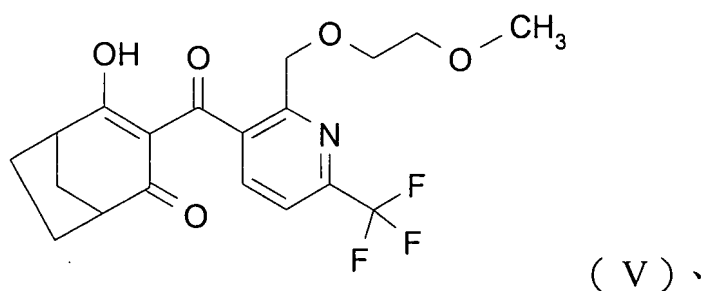
g) R_1 為異丙基， R_2 為三氟甲基， R_3 為氯， R_4 為氫且 X 為 X_8 ；

h) R_1 為異丙基， R_2 為三氟甲基， R_3 為甲基， R_4 為氫且 X 為 X_8 ；

i) R_1 為甲基， R_2 為溴， R_3 為甲基， R_4 為 CN 且 X 為 X_1 ；

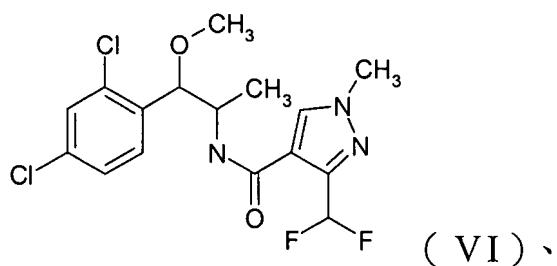
j) R_1 為甲基， R_2 為溴， R_3 為甲基， R_4 為 Cl 且 X 為 X_1 ；

及 (B8) 草甘膦+TX、式 V 化合物+TX

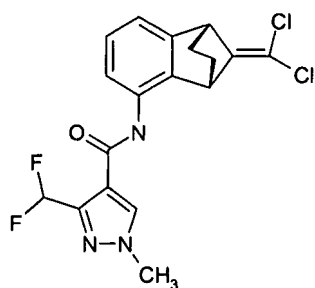


氟磺胺草醚 (fomesafen) +TX，及 (B9) 異皮拉姆 (Isopyrazam) +TX、賽達先 (Sedaxane) +TX、

式 (VI) 化合物+TX



式 (VII) 化合物+TX



(VII)。

較佳組成物包含式 TX 化合物及

(B) 選自由以下組成之群之化合物：

(B1) 噻毬果傘素殺真菌劑+TX, (B2) 唑殺真菌劑+TX, (B3) 嗎啉殺真菌劑+TX, (B4) 苯胺基嘧啶殺真菌劑+TX, (B5) 選自由以下組成之群之殺真菌劑：

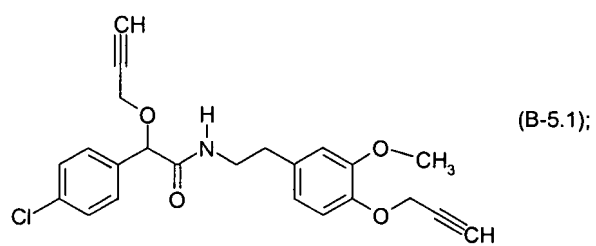
敵菌靈 (878) +TX、砷酸鹽+TX、本達樂 (56) +TX、右本達樂+TX、麥鏽靈 (896) +TX、免賴得 (62) +TX、苯噻菌胺+TX、異丙基苯噻菌胺 (68) +TX、聯苯 (81) +TX、比多農 (84) +TX、殺稻瘟菌素-S (85) +TX、波爾多液 (87) +TX、白克列 (88) +TX、布瑞莫 (98) +TX、氯化鋁+TX、四氯丹 (113) +TX、蓋普丹 (114) +TX、貝芬替 (116) +TX、二硫化碳 (945) +TX、萎鏽靈 (120) +TX、加普胺 (122) +TX、雪松葉油+TX、蟎離丹 (126) +TX、氯+TX、地茂散 (139) +TX、四氯異苯腈 (142) +TX、克氯得 (149) +TX、肉桂醛+TX、銅+TX、碳酸銨銅+TX、氫氧化銅 (169) +TX、辛酸銅 (170) +TX、油酸銅+TX、硫酸銅 (87) +TX、賽座滅 (185) +TX、環己醯亞胺 (1022) +TX、克絕 (200)

+TX、益發靈 (230) +TX、大克隆 (1052) +TX、二氯丙烯
 (233) +TX、二氯西莫 (237) +TX、達滅淨 (239) +TX、
 氯硝胺 (240) +TX、乙徽威 (245) +TX、二氟林 (253)
 +TX、二甲嘧吩 (1082) +TX、達滅芬 (263) +TX、白粉克
 (270) +TX、腈硫醌 (279) +TX、多寧 (289) +TX、護粒
 松 (290) +TX、噻唑菌胺 (304) +TX、依瑞莫 (1133) +TX、
 依得利 (321) +TX、凡殺同 (322) +TX、咪唑菌酮 (325)
 +TX、敵克松 (1144) +TX、芬滅松 (326) +TX、芬瑞莫 (327)
 +TX、甲呋醯胺 (333) +TX、環醯菌胺 (334) +TX、氰菌
 胺 (338) +TX、拌種咯 (341) +TX、三苯醋錫 (347) +TX、
 三苯氯錫 +TX、三苯羥錫 (347) +TX、福美鐵 (350) +TX、
 富米綜 (351) +TX、扶吉胺 (363) +TX、護汰寧 (368)
 +TX、氟硫滅 (394) +TX、福多寧 (396) +TX、福爾培 (400)
 +TX、甲醛 (404) +TX、福賽得 (407) +TX、熱必斯 (643)
 +TX、麥穗靈 (419) +TX、呋霜靈 (410) +TX、福拉比 (411)
 +TX、果綠定 (1205) +TX、富紫亭 (422) +TX、六氯苯 (434)
 +TX、殺紋寧 +TX、克熱淨 (459) +TX、碘克浦 (3-碘-2-
 丙炔基丁基胺基甲酸酯) +TX、丙基喜樂松 (IBP) (469)
 +TX、依普同 (470) +TX、顯徽威 (471) +TX、稻瘟靈 (474)
 +TX、春日徽素 (483) +TX、鋅錳乃浦 (496) +TX、錳乃
 浦 (497) +TX、二甲基二硫代胺基甲酸亞錳 +TX、右滅達
 樂 (517) +TX、滅普寧 (510) +TX、氯化汞 (511) +TX、
 汞 +TX、滅達樂 (516) +TX、滅速克 (528) +TX、免得爛
 (546) +TX、滅芬農 +TX、代森鈉 (566) +TX、印度棟樹油

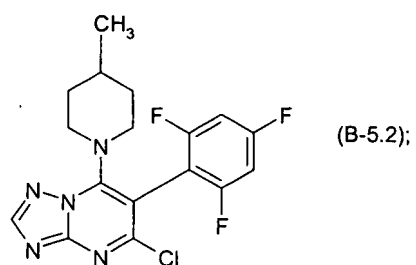
(疏水性萃取物)+TX、尼瑞莫(587)+TX、辛噻酮(590)+TX、呋噻胺(592)+TX、歐殺斯(601)+TX、快得寧(605)+TX、歐索林酸(606)+TX、嘉保信(608)+TX、土黴素(611)+TX、巴克素(612)+TX、石蠟油(628)+TX、三聚甲醛+TX、賓克隆(620)+TX、五氯硝基苯(716)+TX、五氯苯酚(623)+TX、吡噻菌胺+TX、披扶座+TX、磷酸+TX、保粒黴素(654)+TX、保粒黴素D鋅鹽(654)+TX、碳酸氫鉀+TX、撲殺熱(658)+TX、撲滅寧(660)+TX、霜黴威(668)+TX、甲基鋅乃浦(676)+TX、丙氧喹啉(682)+TX、硫菌威(1361)+TX、白粉松(693)+TX、比芬諾(703)+TX、百快隆(710)+TX、快諾芬(715)+TX、五氯硝基苯(PCNB)(716)+TX、矽硫芬(729)+TX、碳酸氫鈉+TX、二乙酸鈉+TX、丙酸鈉+TX、鏈黴素(744)+TX、硫(754)+TX、TCMTB+TX、克枯爛+TX、四氯硝基苯(TCNB)(767)+TX、腐絕(790)+TX、賽氟滅(796)+TX、多保淨(1435)+TX、甲基多保淨(802)+TX、得恩地(804)+TX、脫克松(808)+TX、甲基益發靈(810)+TX、咪唑吡(821)+TX、哈茨木黴(825)+TX、三賽唑(828)+TX、賽福寧(838)+TX、氫氧化三苯錫(347)+TX、維利黴素(846)+TX、免克寧(849)+TX、鋅乃浦(855)+TX、益穗(856)+TX、座賽胺(857)+TX、1,1-雙(4-氯苯基)-2-乙氧基乙醇(IUPAC名)(910)+TX、2+TX,4-二氯苯基苯磺酸酯(IUPAC名/化學摘要名)(1059)+TX、2-氯-N-甲基-N-1-萘基乙醯胺(IUPAC名)(1295)+TX、4-氯苯基苯磺(IUPAC名)

(981) +TX、

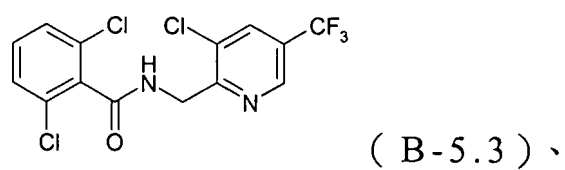
式 B-5.1 化合物 +TX



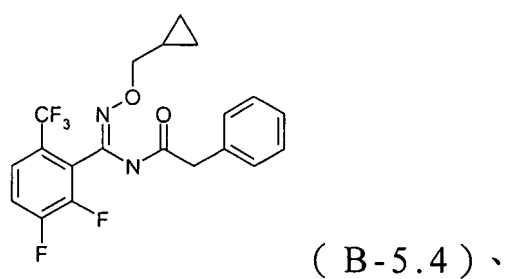
式 B-5.2 化合物 +TX



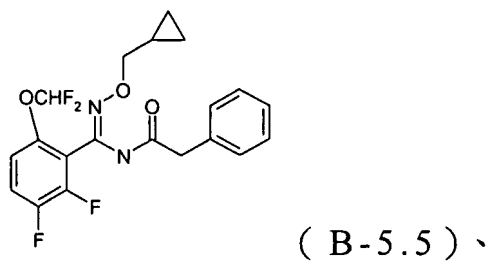
式 B-5.3 化合物 +TX



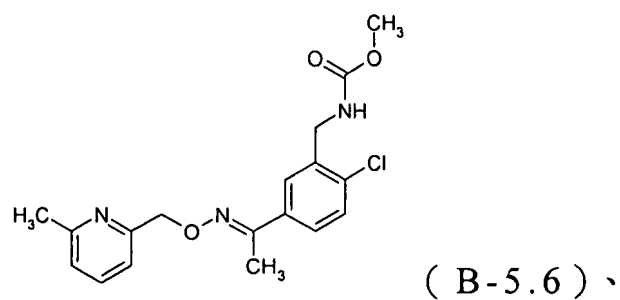
式 B-5.4 化合物 +TX



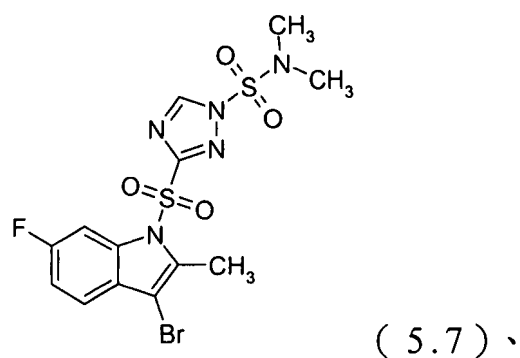
式 B-5.5 化合物+TX



式 B-5.6 化合物+TX



式 B-5.7 化合物+TX



3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸(2-二環丙基-2-基-苯基)-醯胺 (化合物 B-5.8) +TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-

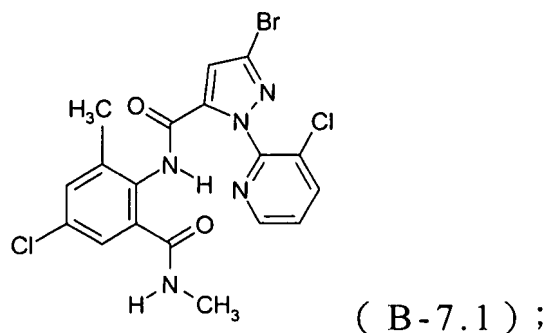
吡啶-4-甲酸(9-異丙基-1,2,3,4-四氫-1,4-亞甲基-萘-5-基)-
 醯胺(化合物 B-5.9)+TX、1,3-二甲基-5-氟-1H-吡啶-4-甲
 酸[2-(1,3-二甲基丁基)苯基]-醯胺(化合物 B-5.10)+TX、
 3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酸(3',4'-二氯-5-氟-1,1'-聯
 苯-2-基)-醯胺(化合物 B-5.11)+TX、N-{2-[3-氯-5-(三氟
 甲基)吡啶-2-基]乙基}-2-(三氟甲基)苄醯胺(化合物 B-5.12)
 +TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酸 N-[2-(1,1,2,2-四
 氟乙氧基)苯基]-醯胺(化合物 B-5.13)+TX、3-二氟甲基-1-
 甲基-1H-吡啶-4-甲酸 N-[2-(1,1,2,3,3,3-六氟丙氧基)苯基]-
 醯胺(化合物 B-5.14)+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶-4-
 甲酸 N-[2-(2-氯-1,1,2-三氟乙氧基)苯基]-醯胺(化合物
 B-5.15)+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酸 N-(4'-三
 氟甲基-聯苯-2-基)-醯胺(化合物 B-5.16)+TX、3-二氟甲
 基-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酸 N-(2'-三氟甲基-聯苯-2-基)-醯胺
 (化合物 B-5.17)及 3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酸
 N-(2'-三氟甲基-聯苯-2-基)-醯胺(化合物 B-5.18)；

(B6) 選自由以下組成之群之植物生物調節劑：

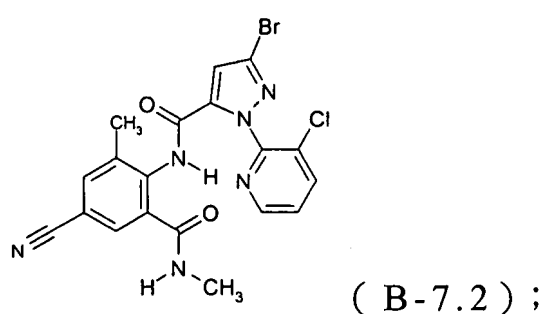
酸化苯并噻二唑-S-甲酯(6)+TX、矮壯素(137)+TX、
 益收生長素(307)+TX、縮節胺(509)及抗倒酯(841)；

(B7) 選自由以下組成之群之殺蟲劑：

阿巴汀(1)+TX、可尼丁(165)+TX、因滅汀(291)
 +TX、益達胺(458)+TX、七氟菊酯(769)+TX、噻蟲吡
 (792)+TX、式 B-7.1 化合物+TX



及 式 B-7.2 化 合 物 +TX

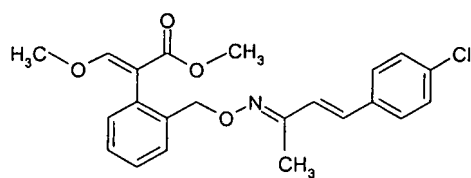


及 (B8) 草 甘 膦 (419) +TX。

尤 其 合 適 之 混 合 物 實 例 選 自 下 組 P：

組 P：尤 其 合 適 之 本 發 明 混 合 物：

選 自 以 下 之 嗜 毬 果 傘 素 殺 真 菌 劑：亞 托 敏 (azoxystrobin) (47) +TX、醚 菌 胺 (dimoxystrobin) (226) +TX、氟 嘧 菌 酯 (fluoxastrobin) (382) +TX、克 收 欣 (kresoxim-methyl) (485) +TX、苯 氧 菌 胺 (metominostrobin) (551) +TX、肟 醚 菌 胺 (orysastrobin) +TX、啉 氧 菌 酯 (picoxystrobin) (647) +TX、百 克 敏 (pyraclostrobin) (690)；三 氟 敏 (trifloxystrobin) (832) +TX、式 B-1.1 化 合 物 +TX

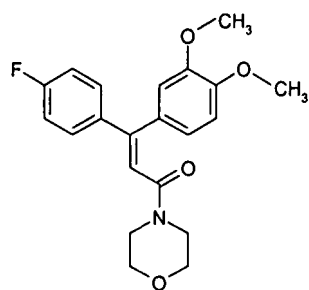


(B-1.1) ;

選自以下之唑殺真菌劑：阿紫康唑 (azaconazole) (40)
 +TX、溴克座 (bromuconazole) (96) +TX、環克座
 (cyproconazole) (207) +TX、待克利 (difenoconazole) (247)
 +TX、達克利 (diniconazole) (267) +TX、右達克利
 (diniconazole-M) (267) +TX、氟環唑 (epoxiconazole) (298)
 +TX、芬克座 (fenbuconazole) (329) +TX、氟喹唑
 (fluquinconazole) (385) +TX、護矽得 (flusilazole) (393)
 +TX、護汰芬 (flutriafol) (397) +TX、菲克利 (hexaconazole)
 (435) +TX、依滅列 (imazalil) (449) +TX、易胺座
 (imibenconazole) (457) +TX、依普克唑 (ipconazole) (468)
 +TX、滅特座 (metconazole) (525) +TX、邁克尼
 (myclobutanil) (564) +TX、噁咪唑 (oxpoconazole) (607)
 +TX、披扶座 (pefurazoate) (618) +TX、平克座 (penconazole)
 (619) +TX、撲克拉 (prochloraz) (659) +TX、普克利
 (propiconazole) (675) +TX、丙硫菌唑 (prothioconazole)
 (685) +TX、矽氟唑 (simeconazole) (731) +TX、得克利
 (tebuconazole) (761) +TX、四克利 (tetraconazole) (778)
 +TX、三泰芬 (triadimefon) (814) +TX、三泰隆 (triadimenol)
 (815) +TX、賽福座 (triflumizole) (834) +TX、滅菌唑
 (triticonazole) (842) +TX、苜氯三唑醇 (diclobutrazol)
 (1068) +TX、乙環唑 (etaconazole) (1129) +TX、呋醚唑

(furconazole) (1198) +TX、順式呋醚唑 (furconazole-cis) (1199) 及喹唑 (quinconazole) (1378) ;

選自以下之嗎啉殺真菌劑混合物：阿迪嗎啉 (aldimorph) +TX、嗎菌靈 (dodemorph) (288) +TX、芬普福 (fenpropimorph) (344) +TX、三得芬 (tridemorph) (830) +TX、苯鏽啉 (fenpropidin) (343) +TX、螺噁茂胺 (spiroxamine) (740) +TX、粉病靈 (piperalin) (648) 及式 B-3.1 化合物+TX



(B-3.1) ;

選自以下之苯胺基嘧啶殺真菌劑：賽普洛 (cyprodinil) (208) +TX、滅派林 (mepanipyrim) (508) 及派美尼 (pyrimethanil) (705) ;

選自由以下組成之群之殺真菌劑混合物：

敵菌靈 (878) +TX、砷酸鹽+TX、本達樂 (56) +TX、右本達樂+TX、麥鏽靈 (896) +TX、免賴得 (62) +TX、苯噻菌胺+TX、異丙基苯噻菌胺 (68) +TX、聯苯 (81) +TX、比多農 (84) +TX、殺稻瘟菌素-S (85) +TX、波爾多液 (87) +TX、白克列 (88) +TX、布瑞莫 (98) +TX、氯化鋁+TX、四氯丹 (113) +TX、蓋普丹 (114) +TX、貝芬替 (116)

+TX、二硫化碳（945）+TX、萎鏽靈（120）+TX、加普胺（122）+TX、雪松葉油+TX、蟎離丹（126）+TX、氯+TX、地茂散（139）+TX、四氯異苯腈（142）+TX、克氯得（149）+TX、肉桂醛+TX、銅+TX、碳酸銨銅+TX、氫氧化銅（169）+TX、辛酸銅（170）+TX、油酸銅+TX、硫酸銅（87）+TX、賽座滅（185）+TX、環己醯亞胺（1022）+TX、克絕（200）+TX、益發靈（230）+TX、大克隆（1052）+TX、二氯丙烯（233）+TX、二氯西莫（237）+TX、達滅淨（239）+TX、氯硝胺（240）+TX、乙徽威（245）+TX、二氟林（253）+TX、二甲嘧吩（1082）+TX、達滅芬（263）+TX、白粉克（270）+TX、腈硫醌（279）+TX、多寧（289）+TX、護粒松（290）+TX、噻唑菌胺（304）+TX、依瑞莫（1133）+TX、依得利（321）+TX、凡殺同（322）+TX、咪唑菌酮（325）+TX、敵克松（1144）+TX、芬滅松（326）+TX、芬瑞莫（327）+TX、甲呋醯胺（333）+TX、環醯菌胺（334）+TX、氟菌胺（338）+TX、拌種咯（341）+TX、三苯醋錫（347）+TX、三苯氯錫+TX、三苯羥錫（347）+TX、福美鐵（350）+TX、富米綜（351）+TX、扶吉胺（363）+TX、護汰寧（368）+TX、氟硫滅（394）+TX、福多寧（396）+TX、福爾培（400）+TX、甲醛（404）+TX、福賽得（407）+TX、熱必斯（643）+TX、麥穗靈（419）+TX、呋霜靈（410）+TX、福拉比（411）+TX、果綠定（1205）+TX、富紫亭（422）+TX、六氯苯（434）+TX、殺紋寧+TX、克熱淨（459）+TX、碘克浦（3-碘-2-丙炔基丁基胺基甲酸酯）+TX、丙基喜樂松（IBP）（469）

+TX、依普同 (470) +TX、顯徽威 (471) +TX、稻瘟靈 (474)
 +TX、春日黴素 (483) +TX、鋅錳乃浦 (496) +TX、錳乃
 浦 (497) +TX、二甲基二硫代胺基甲酸亞錳 +TX、右減達
 樂 (517) +TX、減普寧 (510) +TX、氯化汞 (511) +TX、
 汞 +TX、減達樂 (516) +TX、減速克 (528) +TX、免得爛
 (546) +TX、滅芬農 +TX、代森鈉 (566) +TX、印度棟樹油
 (疏水性萃取物) +TX、尼瑞莫 (587) +TX、辛噻酮 (590)
 +TX、呋醯胺 (592) +TX、歐殺斯 (601) +TX、快得寧 (605)
 +TX、歐索林酸 (606) +TX、嘉保信 (608) +TX、土黴素
 (611) +TX、巴克素 (612) +TX、石蠟油 (628) +TX、三
 聚甲醛 +TX、賓克隆 (620) +TX、五氯硝基苯 (716) +TX、
 五氯苯酚 (623) +TX、吡噻菌胺 +TX、披扶座 +TX、磷酸
 +TX、保粒黴素 (654) +TX、保粒黴素 D 鋅鹽 (654) +TX、
 碳酸氫鉀 +TX、撲殺熱 (658) +TX、撲滅寧 (660) +TX、
 霜黴威 (668) +TX、甲基鋅乃浦 (676) +TX、丙氧喹啉 (682)
 +TX、硫菌威 (1361) +TX、白粉松 (693) +TX、比芬諾 (703)
 +TX、百快隆 (710) +TX、快諾芬 (715) +TX、五氯硝基
 苯 (PCNB) (716) +TX、矽硫芬 (729) +TX、碳酸氫鈉 +TX、
 二乙酸鈉 +TX、丙酸鈉 +TX、鏈黴素 (744) +TX、硫 (754)
 +TX、TCMTB +TX、克枯爛 +TX、四氯硝基苯 (TCNB) (767)
 +TX、腐絕 (790) +TX、賽氟滅 (796) +TX、多保淨 (1435)
 +TX、甲基多保淨 (802) +TX、得恩地 (804) +TX、脫克
 松 (808) +TX、甲基益發靈 (810) +TX、咪唑吡 (821)
 +TX、哈茨木黴 (825) +TX、三賽唑 (828) +TX、賽福寧

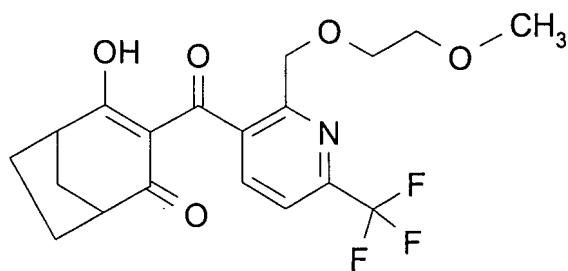
(838) +TX、氫氧化三苯錫 (347) +TX、維利黴素 (846) +TX、免克寧 (849) +TX、鋅乃浦 (855) +TX、益穗 (856) +TX、座賽胺 (857) +TX、1+TX,1-雙(4-氯苯基)-2-乙氧基乙醇 (IUPAC 名) (910) +TX、2+TX,4-二氯苯基苯磺酸酯 (IUPAC 名/化學摘要名) (1059) +TX、2-氟-N-甲基-N-1-萘基乙醯胺 (IUPAC 名) (1295) +TX、4-氯苯基苯磺 (IUPAC 名) (981) +TX、式 B-5.1 化合物+TX、式 B-5.2 化合物+TX、式 B-5.3 化合物+TX、式 B-5.4 化合物+TX、式 B-5.5 化合物+TX、式 B-5.6 化合物+TX、式 B-5.7 化合物+TX、化合物 B-5.8+TX、化合物 B-5.9+TX、化合物 B-5.10+TX、化合物 B-5.11+TX、化合物 B-5.12+TX、化合物 B-5.13+TX、化合物 B-5.14+TX、化合物 B-5.15+TX、化合物 B-5.16+TX、化合物 B-5.17 及化合物 B-5.18；

選自由以下組成之群之植物生物調節劑：

酸化苯并噻二唑-S-甲酯 (6) +TX、矮壯素 (137) +TX、益收生長素 (307) +TX、縮節胺 (509) 及抗倒酯 (841)；

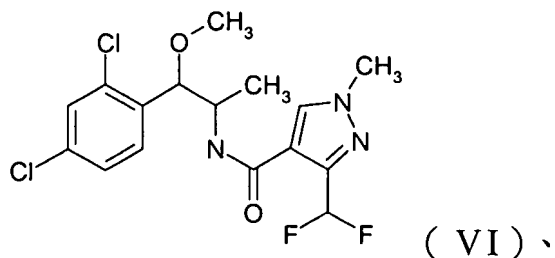
選自由以下組成之群之殺蟲劑：

阿巴汀 (1) +TX、可尼丁 (165) +TX、因滅汀 (291) +TX、益達胺 (458) +TX、七氟菊酯 (769) +TX、噻蟲吡 (792) +TX、及草甘膦 (419) +TX、式 (V) 化合物+TX

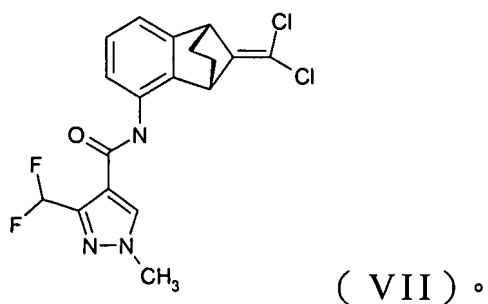


(V)、

氟磺胺草醚+TX、及(B9)異皮拉姆+TX、賽達先+TX、
式(VI)化合物+TX



式(VII)化合物+TX



尤其合適之混合物的其他實例選自下組 Q：

組 Q：尤其合適之本發明組成物：

選自由以下組成之群之嗜毬果傘素殺真菌劑：亞托敏+TX、醚菌胺+TX、氟嘧菌酯+TX、克收欣+TX、苯氧菌胺+TX、肟醚菌胺+TX、啉氧菌酯+TX、百克敏；三氟敏及式B-1.1化合物；

選自由以下組成之群之唑殺真菌劑：阿紫康唑+TX、溴克座+TX、環克座+TX、待克利+TX、達克利+TX、右達克利+TX、氟環唑+TX、芬克座+TX、氟喹唑+TX、護矽得+TX、

護汰芬+TX、菲克利+TX、依滅列+TX、易胺座+TX、依普克唑+TX、滅特座+TX、邁克尼+TX、噁咪唑+TX、披扶座+TX、平克座+TX、撲克拉+TX、普克利+TX、丙硫菌唑+TX、矽氟唑+TX、得克利+TX、四克利+TX、三泰芬+TX、三泰隆+TX、賽福座+TX、滅菌唑+TX、苜氣三唑醇+TX、乙環唑+TX、呋醚唑+TX、順式呋醚唑及喹唑；

選自由以下組成之群之嗎啉殺真菌劑：阿迪嗎啉+TX、嗎菌靈+TX、芬普福+TX、三得芬+TX、苯鏽啉+TX、螺噁茂胺+TX、粉病靈及式 B-3.1 化合物；

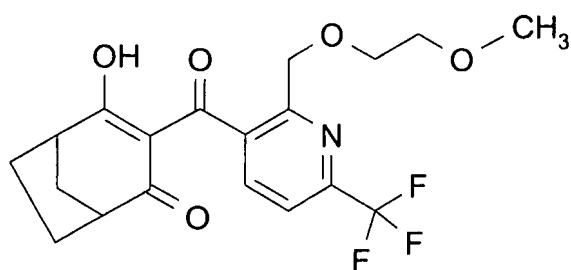
選自由以下組成之群之苯胺基嘧啶殺真菌劑：賽普洛+TX、滅派林及派美尼；

選自由以下組成之群之殺真菌劑：本達樂+TX、右本達樂+TX、免賴得+TX、比多農+TX、白克列+TX、蓋普丹+TX、萎鏽靈+TX、加普胺+TX、四氯異苯腈+TX、銅+TX、賽座滅+TX、克絕+TX、乙徽威+XT、腈硫醯 (fenoxycarb) +TX、凡殺同+TX、咪唑菌酮+TX、環醯菌胺+TX、雙氧威+TX、拌種咯+TX、扶吉胺+TX、護汰寧+TX、福多寧+TX、福爾培+TX、雙胍鹽 (guazatine) +TX、殺紋寧+TX、依普同+TX、祿芬隆 (lufenuron) +TX、鋅錳乃浦+TX、滅達樂+TX、右滅達樂+TX、滅芬農+TX、尼瑞莫+TX、巴克素+TX、賓克隆+TX、吡噻菌胺+TX、撲滅寧+TX、丙氧喹啉+TX、百快隆+TX、快諾芬+TX、矽硫芬+TX、硫+TX、腐絕+TX、得恩地+TX、咪唑吡+TX、三賽唑+TX、式 B-5.1 化合物+TX、式 B-5.2 化合物+TX、式 B-5.3 化合物+TX、式 B-5.4 化

物+TX、式 B-5.5 化合物+TX、式 B-5.6 化合物+TX、式 B-5.7 化合物+TX、式 B-5.8 化合物+TX、式 B-5.9 化合物+TX、式 B-5.10 化合物及式 B-5.12 化合物；

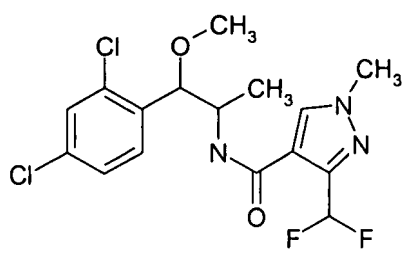
選自以下之植物生物調節劑：酸化苯并噻二唑-S-甲酯+TX、矮壯素+TX、益收生長素+TX、縮節胺及抗倒酯；

選自以下之殺蟲劑：阿巴汀+TX、因滅汀+TX、七氟菊酯+TX、噻蟲吡+TX 及草甘膦+TX、式 V 化合物



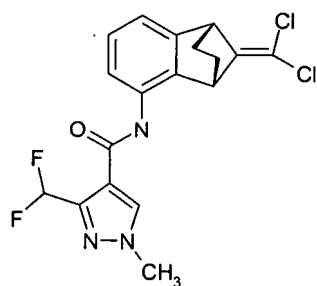
(V) +TX、

氟磺胺草醚+TX，及 (B9) 異皮拉姆+TX、賽達先+TX、式 (VI) 化合物+TX



(VI)、

式 (VII) 化合物+TX



(VII)。

已發現組分 (B) 與組分 TX 組合使用可驚人地且實質上增強後者抗真菌之有效性，反之亦然。另外，本發明之方法有效抵抗較廣範圍之真菌，當單獨使用該方法之活性成份時，該等真菌可能對該等活性成份產生抗性。

一般而言，組分 TX 與組分 (B) 之重量比為 2000:1 至 1:1000。該等重量比之非限制性實例為式 I 化合物:式 B-2 化合物為 10:1。組分 TX 與組分 (B) 之重量比較佳為 100:1 至 1:100；更佳為 20:1 至 1:50。

組分 TX 與組分 (B) 之活性成份混合物包含式 I 化合物及其他殺生物活性成份或組成物或 (若需要) 固體或液體佐劑，其混合比率較佳為 1000:1 至 1:1000，特別為 50:1 至 1:50，更特別為 20:1 至 1:20 之比率，甚至更特別為 10:1 至 1:10，極特別為 5:1 至 1:5，尤其較佳為 2:1 至 1:2 之比率，及同樣較佳為 4:1 至 2:1 之比率，尤其為 1:1、或 5:1、或 5:2、或 5:3、或 5:4、或 4:1、或 4:2、或 4:3、或 3:1、或 3:2、或 2:1、或 1:5、或 2:5、或 3:5、或 4:5、或 1:4、或 2:4、或 3:4、或 1:3、或 2:3、或 1:2、或 1:600、或 1:300、或 1:150、或 1:35、或 2:35、或 4:35、或 1:75、或 2:75、或 4:75、或 1:6000、或 1:3000、或 1:1500、或 1:350、或 2:350、

或 4:350、或 1:750、或 2:750、或 4:750 之比率。彼等混合比率應理解為一方面包括重量比，且另一方面亦包括莫耳比。

已驚人地發現，組分 TX 與組分 (B) 之某些重量比能夠產生協同活性。因此，本發明之另一態樣為組成物，其中組分 TX 及組分 (B) 以產生協同效應之量存在於該組成物中。此協同活性顯而易見於以下實情：包含組分 TX 及組分 (B) 之組成物的殺真菌活性大於組分 TX 之殺真菌活性與組分 (B) 之殺真菌活性的總和。此協同活性以兩種方式擴展組分 TX 及組分 (B) 之作用範圍。首先，組分 TX 及組分 (B) 之施用量降低，但作用效果仍一樣良好，意謂即使在兩種個別組分在此低施用量範圍內已完全無效時，活性成份混合物仍可高度控制植物病原體。其次，可控制之植物病原體範圍大幅拓寬。

只要活性成份組合之作用大於個別組分作用之總和，即存在協同效應。指定活性成份組合之預期作用 E 符合所謂的 COLBY 式且可如下計算 (COLBY, S.R. 「Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide combination」. Weeds, 第 15 卷, 第 20-22 頁; 1967):

ppm=每公升噴霧混合物之活性成份 (=a.i.) 毫克數

X=使用 p ppm 活性成份時，活性成份 A) 之作用 %

Y=使用 q ppm 活性成份時，活性成份 B) 之作用 %。

根據 COLBY，使用 p+q ppm 活性成份時，活性成份 A) +B) 之預期 (相加) 作用為 $E = X + Y - \frac{X \cdot Y}{100}$ 。

若實際觀測之作用（O）大於預期作用（E），則該組合之作用具有超加性，亦即存在協同效應。在數學術語中，協同效應相當於（O-E）之差值為正值。在活性（預期活性）為完全互補相加的情況下，該差值（O-E）為零。該差值（O-E）為負值意味與預期活性相比，活性降低。

然而，除關於殺真菌活性之實際協同作用之外，本發明之組成物亦可具有其他驚人的有利特性。該等可提及之有利特性的實例為：較有利的降解性；改良之毒理學及/或生態毒理學行為；或改良之有用植物特徵，包括：出苗率、作物產量、更發達的根系、分蘗增加、植物高度增加、葉片更大、更少的基生葉枯死、更強之分蘗、更綠的葉顏色、更少肥料需求、更少種子需求、更多有效分蘗、更早開花、穀粒成熟早、更少植物倒伏、增加之枝條生長、改良之植物活力及萌芽早。

本發明之某些組成物具有內吸作用且可用作葉面、土壤及種子處理殺真菌劑。

對不同有用植物使用本發明之組成物，可抑制或消滅存在於植物或植物之部分（果實、花、葉、莖、塊莖、根）中之植物病原性微生物，同時亦保護以後生長的植物之部分免受植物病原性微生物的侵襲。

可將本發明之組成物施用於植物病原性微生物、受微生物侵襲威脅之有用植物、其所在地、其繁殖材料、儲存貨物或工業材料。

本發明之組成物可在微生物感染有用植物、其繁殖材

料、儲存貨物或工業材料之前或之後施用。

本發明之另一態樣為一種控制有用植物或其繁殖材料上由植物病原體所引起之疾病的方法，其包含將本發明之組成物施用於有用植物、其所在地或其繁殖材料。較佳為一種方法，其包含將本發明之組成物施用於有用植物或其所在地，更佳施用於有用植物。更佳為一種方法，其包含將本發明之組成物施用於有用植物之繁殖材料。

組分 (B) 已知。當組分 (B) 包括於「The Pesticide Manual」[The Pesticide Manual - A World Compendium; 第十三版; 編輯: C. D. S. Tomlin; The British Crop Protection Council]中時，其在該文獻中係以編號描述，該編號出示於上文關於特定組分 (B) 之圓括號中；例如化合物「阿巴汀」以編號 (1) 描述。大部分組分 (B) 在上文中係以所謂「常用名」、相關「ISO 常用名」或個別情況下所用之另一「常用名」提及。若名稱並非「常用名」，則改為在特定組分 (B) 之圓括號中出示所用名稱之性質；在此情況下，使用 IUPAC 名、IUPAC/化學摘要名、「化學名稱」、「慣用名」、「化合物名」或「開發代碼」，或若不使用彼等名稱之一，亦不使用「常用名」，則使用「替代名」。

以下組分 (B) 依以下 CAS 登記號登記：

阿迪嗎啉 (CAS 91315-15-0)；砷酸鹽 (CAS 1327-53-3)；右本達樂 (CAS 98243-83-5)；苯噻菌胺 (CAS 413615-35-7)；氯化鋁 (CAS 10108-64-2)；雪松葉油 (CAS 8007-20-3)；氯 (CAS 7782-50-5)；肉桂醛 (CAS: 104-55-

2); 碳酸銨銅 (CAS 33113-08-5); 油酸銅 (CAS 1120-44-1); 碘克浦 (3-碘-2-丙炔基丁基胺基甲酸酯) (CAS 55406-53-6); 殺紋寧 (CAS 10004-44-1); 二甲基二硫代胺基甲酸亞錳 (CAS 15339-36-3); 汞 (CAS 7487-94-7; 21908-53-2; 7546-30-7); 滅芬農 (CAS 220899-03-6); 印度棟樹油(疏水性萃取物)(CAS 8002-65-1); 脞醚菌胺 (CAS 248593-16-0); 三聚甲醛 (CAS 30525-89-4); 吡噻菌胺 (CAS 183675-82-3); 磷酸 (CAS 7664-38-2); 碳酸氫鉀 (CAS 298-14-6); 碳酸氫鈉 (CAS 144-55-8); 二乙酸鈉 (CAS 127-09-3); 丙酸鈉 (CAS 137-40-6); TCMTB (CAS 21564-17-0); 及甲基益發靈 (CAS 731-27-1)。

化合物 B-1.1 (「烯脞菌酯 (enestrobin)」) 描述於 EP-0-936-213 中; 化合物 B-3.1 (「氟嗎啉 (flumorph)」) 描述於 US-6,020,332、CN-1-167-568、CN-1-155-977 及 EP-0-860-438 中; 化合物 B-5.1 (「曼普胺 (mandipropamid)」) 描述於 WO 01/87822 中; 化合物 B-5.2 描述於 WO 98/46607 中; 化合物 B-5.3 (「氟吡菌胺 (fluopicolide)」) 描述於 WO 99/42447 中; 化合物 B-5.4 (「環氟菌胺 (cyflufenamid)」) 描述於 WO 96/19442 中; 化合物 B-5.5 描述於 WO 99/14187 中; 化合物 B-5.6 (「吡菌苯威 (pyribencarb)」) 以 CAS 登記號 325156-49-8 登記; 化合物 B-5.7 (「安美速 (amisulbrom)」或「安博多 (ambromdole)」) 以 CAS 登記號 348635-87-0 登記; 化合物 B-5.8 (3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸(2-二環丙基-2-基-苯基)-醯胺) 描述於 WO

03/74491 中；化合物 B-5.9 (3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酸(9-異丙基-1,2,3,4-四氫-1,4-亞甲基-萘-5-基)-醯胺) 描述於 WO 04/35589 及 WO 06/37632 中；化合物 B-5.10 (1,3-二甲基-5-氟-1H-吡啶-4-甲酸[2-(1,3-二甲基丁基)苯基]-醯胺) 描述於 WO 03/10149 中；化合物 B-5.11 (3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酸(3',4'-二氯-5-氟-1,1'-聯苯-2-基)-醯胺；「比殺芬 (bixafen)」) 以 CAS 登記號 581809-46-3 登記且描述於 WO 03/70705 中；化合物 B-5.12 (N-{2-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]乙基}-2-(三氟甲基)苄醯胺；「氟吡菌醯胺 (fluopyram)」) 以 CAS 登記號 658066-35-4 登記且描述於 WO 04/16088 中；化合物 B-5.13、B-5.14 及 B-5.15 描述於 WO 2007/17450 中；化合物 B-5.16、B-5.17 及 B-5.18 描述於 WO 2006/120219 中；式 IV 化合物描述於例如 WO 04/067528、WO 2005/085234、WO 2006/111341、WO 03/015519、WO 2007/020050、WO 2006/040113 及 WO 2007/093402 中。式 V 化合物描述於 WO 2001/094339 中。異皮拉姆 (3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[1,2,3,4-四氫-9-(1-甲基乙基)-1,4-亞甲基萘-5-基]-1H-吡啶-4-甲醯胺) 描述於 WO 2004/035589、WO 2006/037632 及 EP1556385B1 中且以 CAS 登記號 881685-58-1 登記。賽達先 (N-[2-[1,1'-二環丙基]-2-基苯基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺) 描述於 WO 2003/074491 中且以 CAS 登記號 874967-67-6 登記；式 (VI) 化合物描述於 WO 2008/014870 中；且式 (VII) 化合物描述於 WO 2007/048556 中。氟磺胺草醚以 CAS 登記號

72178-02-0 登記。

在本文件通篇中，「組成物」一詞代表組分 TX 與 (B) 之各種混合物或組合，例如呈單一「預混」形式；呈由單一活性成份組分之各別調配物組成的組合噴霧混合物，諸如「桶混」；及依序施用（亦即，以適當短的期限（諸如幾小時或幾天）相繼施用）時單一活性成份之組合使用。組分 TX 及 (B) 之施用順序並非實施本發明之關鍵。

若例如需要擴大疾病控制範圍，則本發明之組成物亦可包含一種以上活性組分 (B)。舉例而言，在農業實踐中將兩種或三種組分 (B) 與組分 TX 組合可為有利的。實例為包含式 (I) 化合物、亞托敏及環克座之組成物。

控制或預防意謂將潛在危害人類的植物病原性或腐敗微生物或生物體，尤其真菌生物體對作物植物或無生命物質的侵染減少至表明改善之程度。

此外，本發明之式 (I) 化合物可用作植物生長調節劑或用於植物健康應用。

植物生長調節劑 (PGR) 通常為意欲加快或延緩生長或成熟速率或以其他方式改變植物發育或其生產量之任何物質或混合物。

植物生長調節劑 (PGR) 影響植物生長及分化。

更特定言之，不同植物生長調節劑 (PGR) 可例如降低植物高度、刺激種子萌芽、誘導開花、加深葉色、改變植物生長速率及改進結果時機及效率。

植物健康應用包括例如改善有利特性/作物特徵，其包

括：出苗率、作物產量、蛋白質含量、活力增強、較快成熟、加快種子出苗速度、改良之氮利用效率、改良之水分利用效率、改良之油含量及/或品質、改良之消化性、較快催熟、改良之風味、改良之澱粉含量、更發達的根系（改良之根生長）、改良之逆境耐性（例如抗乾旱、熱、鹽、光、UV、水、寒冷）、減少乙烯（減少生產及/或抑制接受）、增加分蘗、增加植物高度、更大的葉片、更少基生葉枯死、更強分蘗、葉顏色更綠、色素含量、光合活性、更少輸入需求（諸如肥料或水）、更少種子需求、更多有效分蘗、更早開花、穀粒成熟早、更少植物倒伏、增加之枝條生長、增強之植物活力、增加之植物群叢（plant stand）及較早且良好之萌芽。

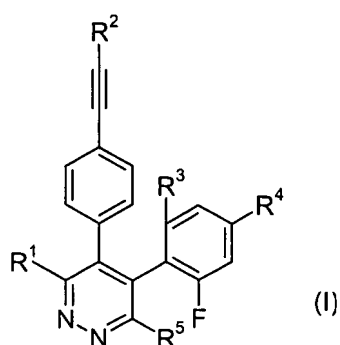
尤其自所處理之種子獲得之有利特性為例如改良之萌芽及田地建立（field establishment）、更佳活力、更均勻的田地建立。

尤其自葉面及/或畦間施用獲得之有利特性為例如改良之植物生長及植物發育、較佳生長、更多分蘗、更綠的葉子、更大的葉子、更多生物量、較佳的根、改良之植物逆境耐性、更多穀粒產量、收穫之生物量更多、改良之收穫品質（脂肪酸、代謝物、油等含量）、更多適銷產物（例如改良之尺寸）、改良之加工（例如較長儲存期、較佳化合物萃取）、改良之種子品質（用於在以後種子產生季節播種）；或熟習此項技術者所熟知的任何其他優勢。

術語植物健康因此包含與控制有害細菌、有害微生物

(其引起疾病)、有害病菌或有害真菌(其引起疾病)無關之各種植物改良。

下表 1 說明本發明之個別式 (I) 化合物及中間體 (I.3) 之實例。



化合物編號	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
1 (I.3)	CH ₃	H	F	F	OH
2	CH ₃	H	F	F	Cl
3	CH ₃	H	F	OCH ₃	Cl
4	CH ₃	H	F	OCH ₃	OCH ₃
5	CH ₃	H	F	F	OCH ₃
6	CH ₃	Cl	F	F	Cl
7	CH ₃	Cl	F	OCH ₃	Cl
8	CH ₃	Cl	F	OCH ₃	OCH ₃
9	CH ₃	H	Cl	F	Cl
10	CH ₃	H	Cl	F	OCH ₃
11	CH ₃	H	Cl	OCH ₃	Cl
12	CH ₃	H	Cl	OCH ₃	OCH ₃
13	CH ₃	Cl	F	F	OCH ₃
14	CH ₃	Cl	Cl	F	Cl
15	CH ₃	Cl	Cl	F	OCH ₃
16	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	Cl
17	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	OCH ₃

以下非限制性實施例更詳細地說明上述本發明。

實施例 1: 此實施例說明 3-氯-5-(4-乙炔基苯基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)吡嗪 (化合物編號 2) 之製備

a) 製備 1-(4-三甲基矽烷基乙炔基苯基)丙-1-酮

1.74 g 4'-溴苯丙酮、2.0 g 乙炔基三甲基矽烷、260 mg 二氯化雙(三苯膦)鈀(II)、260 mg 碘化亞銅(I)及 15 ml 二異丙胺於 40 ml 四氫呋喃中之混合物在回流下加熱 1 小時。冷卻後，反應混合物以水稀釋且以乙酸乙酯萃取。合併之有機層以鹽水洗滌，經硫酸鈉脫水且減壓蒸發。使用庚烷/乙酸乙酯 9:1 之混合物作為溶離劑，藉由矽膠層析純化殘餘物，得到 1-(4-三甲基矽烷基乙炔基苯基)丙-1-酮，熔點 36-37°C。

b) 製備 2-溴-1-(4-三甲基矽烷基乙炔基苯基)丙-1-酮

在 0°C 下緩慢添加溴 (8.4 g) 至 100 ml 四氫呋喃中之 1-(4-三甲基矽烷基乙炔基苯基)丙-1-酮 (10.0 g) 中，隨後在室溫下攪拌 2 小時。反應混合物以水稀釋且以乙酸乙酯萃取。有機層以鹽水洗滌，經硫酸鈉脫水且減壓濃縮。使用庚烷/乙酸乙酯 19:1 之混合物作為溶離劑，藉由矽膠層析純化殘餘物，得到呈黃色固體狀之 2-溴-1-(4-三甲基矽烷基乙炔基苯基)丙-1-酮。

c) 製備 4-(4-乙炔基苯基)-5-羥基-5-甲基-3-(2,4,6-三氟苯基)-5H-呋喃-2-酮

緩慢添加三乙胺 (0.72 g) 至 2-溴-1-(4-三甲基矽烷基乙炔基苯基)丙-1-酮 (1.76 g)、2,4,6-三氟苯基乙酸 (1.35 g) 於 50 ml 乙腈中之溶液中且在室溫下攪拌此混合物 16 小時。隨後在冷卻下緩慢添加 1,8-二氮雜雙環-[5.4.0]十一-7-烯 (DBU, 2.36 g) 且持續攪拌 1 小時。接著向反應混合物內鼓入空氣 1 小時。將反應混合物傾入氯化銨水溶液中且

以乙酸乙酯萃取混合物。合併之有機層以鹽水洗滌，經硫酸鈉脫水且減壓蒸發。使用庚烷/乙酸乙酯 3:1 之混合物作為溶離劑，藉由矽膠層析純化殘餘物，得到呈淺黃色泡沫狀之 4-(4-乙炔基苯基)-5-羥基-5-甲基-3-(2,4,6-三氟苯基)-5H-呋喃-2-酮。

d) 製備 5-(4-乙炔基苯基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)-2H-噻吡-3-酮 (化合物編號 1)

添加水合肼 (0.17 g) 至 0.87 g 4-(4-乙炔基苯基)-5-羥基-5-甲基-3-(2,4,6-三氟苯基)-5H-呋喃-2-酮於 5 ml 1-丁醇中之溶液中且將此混合物加熱至 120°C 歷時 4 小時。減壓蒸發反應混合物且使用甲苯/乙酸乙酯 5:1 之混合物作為溶離劑，藉由矽膠層析純化殘餘物，得到呈無色結晶狀之 5-(4-乙炔基苯基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)-2H-噻吡-3-酮 (化合物編號 1)，熔點 252-254°C。

e) 5-(4-乙炔基苯基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)-2H-噻吡-3-酮 (化合物編號 1, 0.4 g) 及 5 ml 氧氯化磷之混合物在 110°C 下加熱 2 小時。冷卻後，減壓蒸發反應混合物。將殘餘物溶於乙酸乙酯及水中且分離各相。有機層以水及鹽水洗滌，經硫酸鈉脫水且減壓蒸發。使用庚烷/乙酸乙酯 4:1 之混合物作為溶離劑，藉由矽膠層析純化殘餘物，得到呈無色結晶狀之 3-氯-5-(4-乙炔基苯基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)噻吡 (化合物編號 2)，熔點 174-175°C。

實施例 2：此實施例說明 4-(2,6-二氟-4-甲氧基苯基)-5-(4-乙炔基苯基)-3-甲氧基-6-甲基噻吡 (化合物編號 4)

之製備

將 3-氯-5-(4-乙炔基苯基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基) 嗒吡 (化合物編號 2, 1.0 g)、甲醇鈉 (30% 甲醇溶液, 1.78 g) 及 20 ml 四氫呋喃之混合物加熱至 55°C 歷時 2 小時。隨後冷卻反應混合物, 以水稀釋且以乙酸乙酯萃取。合併之有機層以水及鹽水洗滌, 經硫酸鈉脫水且減壓蒸發。使用庚烷/乙酸乙酯 2:1 之混合物作為溶離劑, 藉由矽膠層析純化殘餘物, 得到呈無色結晶狀之 4-(2,6-二氟-4-甲氧基苯基)-5-(4-乙炔基苯基)-3-甲氧基-6-甲基嗒吡 (化合物編號 4), 熔點 192-193°C。

生物實施例

番茄輪紋病菌 (*Alternaria solani*) / 番茄 / 預防性 (作用於番茄輪紋病)

在噴霧室中以所調配之測試化合物處理 4 週齡番茄植物栽培品種羅特吉諾 (Roter Gnom)。在施用後兩天藉由噴以孢子懸浮液來接種該等測試植物。在溫室中、在 22/18°C (日/夜) 及 95% 相對濕度 (rh) 下培育接種之測試植物, 且在適當程度之疾病出現於未處理之對照植物上時 (施用後 5 至 7 天), 評估疾病所覆蓋之葉面積百分比。

在此測試中, 本發明化合物 2 及 4 在 200 ppm 下抑制真菌侵染達至少 80%, 而在相同條件下, 植物病原性真菌侵染未處理之對照植物則超過 80%。

富氏葡萄孢盤菌 (*Botryotinia fuckeliana*) (灰黴菌 (*Botrytis cinerea*)) / 番茄 / 預防性 (作用於番茄灰黴病)

在噴霧室中以所調配之測試化合物處理 4 週齡番茄植物栽培品種羅特吉諾。在施用後兩天藉由噴以孢子懸浮液來接種該等測試植物。在溫室中、在 20℃及 95%相對濕度下培育接種之測試植物，且在適當程度之疾病出現於未處理之對照植物上時（施用後 5 至 6 天），評估疾病所覆蓋之葉面積百分比。

在此測試中，本發明化合物 2 及 4 在 200 ppm 下抑制真菌侵染達至少 80%，而在相同條件下，植物病原性真菌侵染未處理之對照植物則超過 80%。

葡萄白粉菌（*Erysiphe necator*）（葡萄鉤絲殼菌（*Uncinula necator*））/葡萄/預防性（作用於葡萄白粉病）

在噴霧室中以所調配之測試化合物處理 5 週齡葡萄幼苗栽培品種古特德（Gutedel）。在施用後 1 天藉由搖動感染葡萄白粉病之植物來接種該等測試植物。在 24/22℃（日/夜）及 70%相對濕度下，依據 14/10 小時（光/暗）之光照方案培育接種之測試植物，且在適當程度之疾病出現於未處理之對照植物上時（施用後 7 至 9 天），評估疾病所覆蓋之葉面積百分比。

在此測試中，本發明化合物 2 在 200 ppm 下抑制真菌侵染達至少 80%，而在相同條件下，植物病原性真菌侵染未處理之對照植物則超過 80%。

稻瘟病菌（*Magnaporthe grisea*）（稻梨孢（*Pyricularia oryzae*））/水稻/預防性（作用於稻瘟病）

在噴霧室中以所調配之測試化合物處理 3 週齡水稻植

物栽培品種越光 (Koshihikari)。在施用後兩天藉由噴以孢子懸浮液來接種該等測試植物。在 25℃ 及 95% 相對濕度下培育接種之測試植物，且在適當程度之疾病出現於未處理之對照植物上時（施用後 7 至 9 天），評估疾病所覆蓋之葉面積百分比。

在此測試中，本發明化合物 2 及 4 在 200 ppm 下抑制真菌侵染達至少 80%，而在相同條件下，植物病原性真菌侵染未處理之對照植物則超過 80%。

小麥斑點病菌 (*Mycosphaerella graminicola*) (小麥殼針孢菌 (*Septoria tritici*)) /小麥/預防性 (作用於小麥殼針孢葉斑病)

在噴霧室中以所調配之測試化合物處理 2 週齡小麥植物栽培品種雷邦 (Riband)。在施用後一天藉由噴以孢子懸浮液來接種該等測試植物。在 22℃/21℃ (日/夜) 及 95% 相對濕度下培育 1 天時間後，在溫室中、在 22℃/21℃ (日/夜) 及 70% 相對濕度下維持該等測試植物。在適當程度之疾病出現於未處理之對照植物上時（施用後 16 至 19 天），評估疾病所覆蓋之葉面積百分比。

在此測試中，本發明化合物 2 及 4 在 200 ppm 下抑制真菌侵染達至少 80%，而在相同條件下，植物病原性真菌侵染未處理之對照植物則超過 80%。

小麥斑點病菌 (小麥殼針孢菌) /小麥/治療性 (作用於小麥殼針孢葉斑病)

藉由噴以孢子懸浮液來接種 2 週齡小麥植物栽培品種

雷邦。在 22°C/21°C (日/夜) 及 95%相對濕度下培育 2 天時間後，在氣候室中、在 22°C/21°C (日/夜) 及 70%相對濕度下維持該等測試植物。在接種後 5 天，在噴霧室中以所調配之測試化合物處理接種之測試植物。在適當程度之疾病出現於未處理之對照植物上時 (施用後 11 至 14 天)，評估疾病所覆蓋之葉面積百分比。

在此測試中，本發明化合物 2 及 4 在 200 ppm 下抑制真菌侵染達至少 80%，而在相同條件下，植物病原性真菌侵染未處理之對照植物則超過 80%。

小麥赤鏽菌 (*Puccinia recondita*) /小麥/預防性 (作用於小麥褐銹病)

在噴霧室中以所調配之測試化合物處理 2 週齡小麥植物栽培品種阿瑞娜 (Arina)。在施用後一天藉由噴以孢子懸浮液來接種該等測試植物。在 20°C 及 95%相對濕度下培育 1 天時間後，在溫室中、在 20°C/18°C (日/夜) 及 60%相對濕度下維持該等測試植物。在適當程度之疾病出現於未處理之對照植物上時 (施用後 12 至 14 天)，評估疾病所覆蓋之葉面積百分比。

在此測試中，本發明化合物 2 在 200 ppm 下抑制真菌侵染達至少 80%，而在相同條件下，植物病原性真菌侵染未處理之對照植物則超過 80%。

大麥網斑病菌 (*Pyrenophora teres*) (大麥網紋病菌 (*Helminthosporium teres*)) /大麥/預防性 (作用於大麥網斑病)

在噴霧室中以所調配之測試化合物處理 1 週齡大麥植物栽培品種里賈納 (Regina)。在施用後 2 天藉由噴以孢子懸浮液來接種該等測試植物。在 20°C 及 95% 相對濕度下培育接種之測試植物，且在適當程度之疾病出現於未處理之對照植物上時（施用後 5 至 7 天），評估疾病所覆蓋之葉面積百分比。

在此測試中，本發明化合物 2 及 4 在 200 ppm 下抑制真菌侵染達至少 80%，而在相同條件下，植物病原性真菌侵染未處理之對照植物則超過 80%。

【圖式簡單說明】

無

【主要元件符號說明】

無

發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：100103818

※申請日：100.2.1

※IPC 分類：

A01N 43/58 (2006.01)

A01N 43/08 (2006.01)
A01P 3/00

一、發明名稱：(中文/英文)

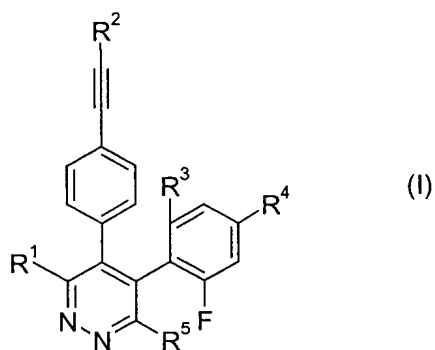
新穎化合物

NOVEL COMPOUNDS

(2006.01)

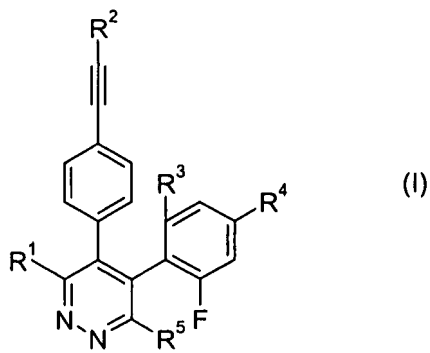
二、中文發明摘要：

本發明係關於新穎的式(I) 嗒咩衍生物，其作為活性成份具有殺微生物活性，尤其殺真菌活性



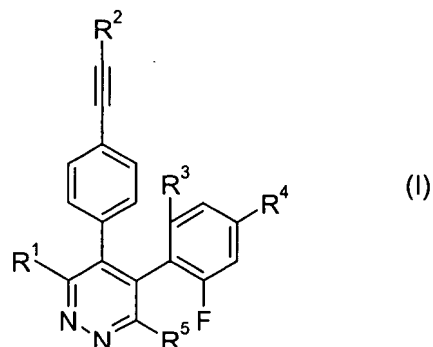
三、英文發明摘要：

The present invention relates to novel pyridazine derivatives of formula (I) as active ingredients which have microbiocidal activity, in particular fungicidal activity



七、申請專利範圍：

1. 一種式 (I) 化合物，



其中

R^1 為甲基或乙基；

R^2 為 H 或氯；

R^3 為氟或氯；

R^4 為氟或甲氧基；且

R^5 為氯或甲氧基，

或其農用化學上可用之鹽形式。

2. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其中

R^1 為甲基；

R^2 為 H；

R^3 為氟；

R^4 為氟或甲氧基；且

R^5 為氯。

3. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其係選自

3-氯-5-(4-乙炔基苯基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)嗒
吡；

3-氯-4-(2,6-二氟-4-甲氧基苯基)-5-(4-乙炔基苯
基)-6-甲基嗒吡；

4-(2,6-二氟-4-甲氧基苯基)-5-(4-乙炔基苯基)-3-甲氧基-6-甲基嗒吡；

4-(4-乙炔基苯基)-6-甲氧基-3-甲基-5-(2,4,6-三氟苯基)嗒吡；

3-氟-5-(4-氯乙炔基苯基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)嗒吡；及

3-氟-5-(4-氯乙炔基苯基)-4-(2,6-二氟-4-甲氧基苯基)-6-甲基嗒吡。

4.一種控制或防止植物病原性微生物之殺真菌組成物，其包含至少一種呈自由形式或農用化學上可用之鹽形式的如申請專利範圍第1項至第3項中任一項之化合物作為活性成份，及至少一種佐劑。

5.如申請專利範圍第4項之組成物，其進一步包含至少一種其他殺真菌活性化合物，較佳選自由以下組成之群：唑、嘧啶基甲醇（pyrimidinyl carbinols）、2-胺基-嘧啶、嗎啉、苯胺基嘧啶、吡咯、苯醯胺、苯并咪唑、二甲醯亞胺、甲醯胺、嗜球果傘素（strobilurine）、二硫胺基甲酸酯、N-鹵甲基硫代四氫鄰苯二甲醯亞胺、銅化合物、硝基苯酚、有機磷衍生物、嗒吡、三唑并嘧啶、甲醯胺及苄醯胺。

6.一種如申請專利範圍第1項至第3項中任一項之化合物的用途，其係用於控制或預防植物病原性微生物侵染植物、所收穫之糧食作物、種子或無生命物質。

7.一種控制或預防潛在危害人類之植物病原性或腐敗微生物或生物體侵染作物植物、所收穫之糧食作物或無生

命物質之方法，其包含將如申請專利範圍第 1 項至第 3 項中任一項之化合物作為活性成份施用於該植物、該等植物之部分或其所在地、種子或該等無生命物質之任何部分。

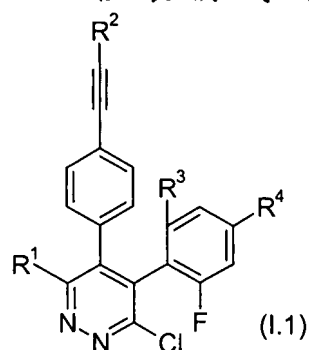
8.如申請專利範圍第 7 項之方法，其中該控制係藉助於治療性施用。

9.如申請專利範圍第 7 項或第 8 項之方法，其中該病原性微生物為真菌生物體。

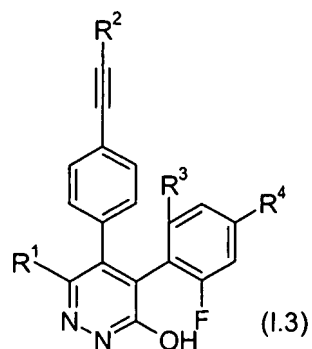
10.如申請專利範圍第 7 項至第 9 項中任一項之方法，其中該真菌生物體係選自番茄輪紋病菌 (*Alternaria solani*)、富氏葡萄孢盤菌 (*Botryotinia fuckeliana*)、葡萄白粉菌 (*Erysiphe necator*)、稻瘟病菌 (*Magnaporthe grisea*)、小麥斑點病菌 (*Mycosphaerella graminicola*)、小麥赤鏽菌 (*Puccinia recondite*) 及大麥網斑病菌 (*Pyrenophora teres*)。

11.如申請專利範圍第 10 項之方法，其中該真菌生物體為小麥斑點病菌。

12.一種製備式 (I.1) 化合物之方法，

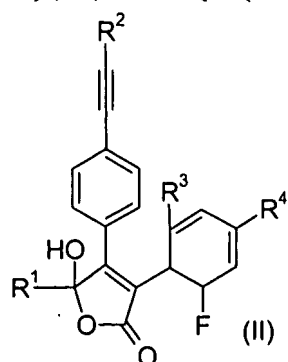


其包含使式 (I.3) 化合物



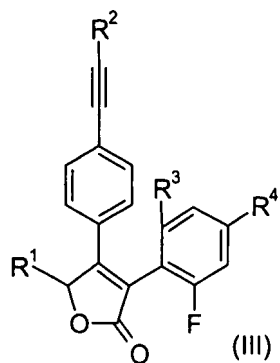
與氧氯化磷或亞硫醯氯反應；

其中該式 (I.3) 化合物視情況由式 (II) 化合物



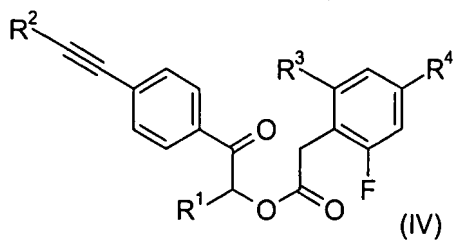
與肼衍生物反應來製備；

其中該式 (II) 化合物視情況由式 (III) 化合物



與氧氣、空氣或 3-氯過苯甲酸反應來製備；

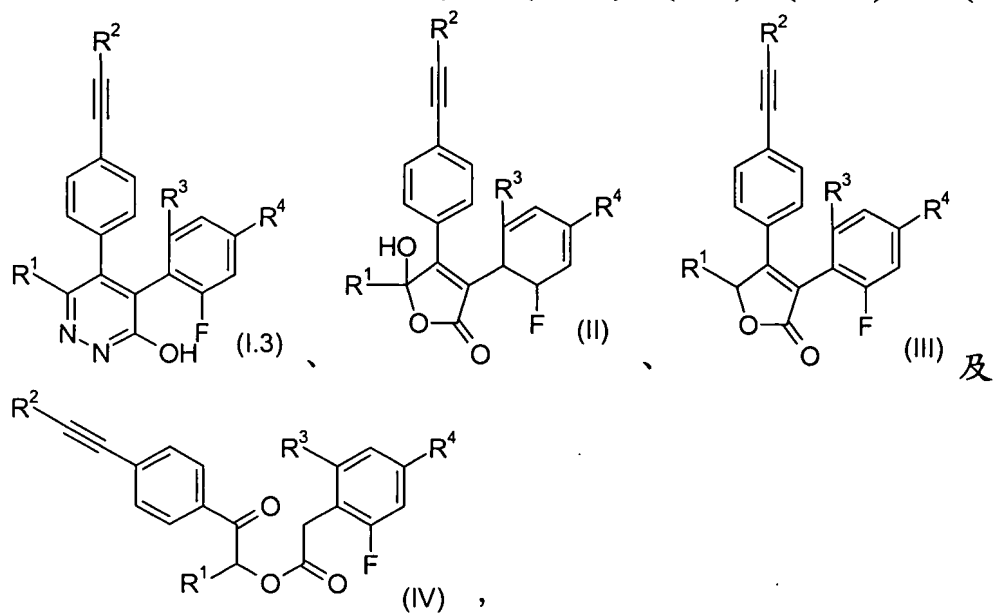
其中該式 (III) 化合物視情況由式 (IV) 化合物



與鹼反應來製備；

其中 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 係如申請專利範圍第 1 項中所定義。

13. 一種化合物，其係選自 (I.3)、(II)、(III) 及 (IV)：



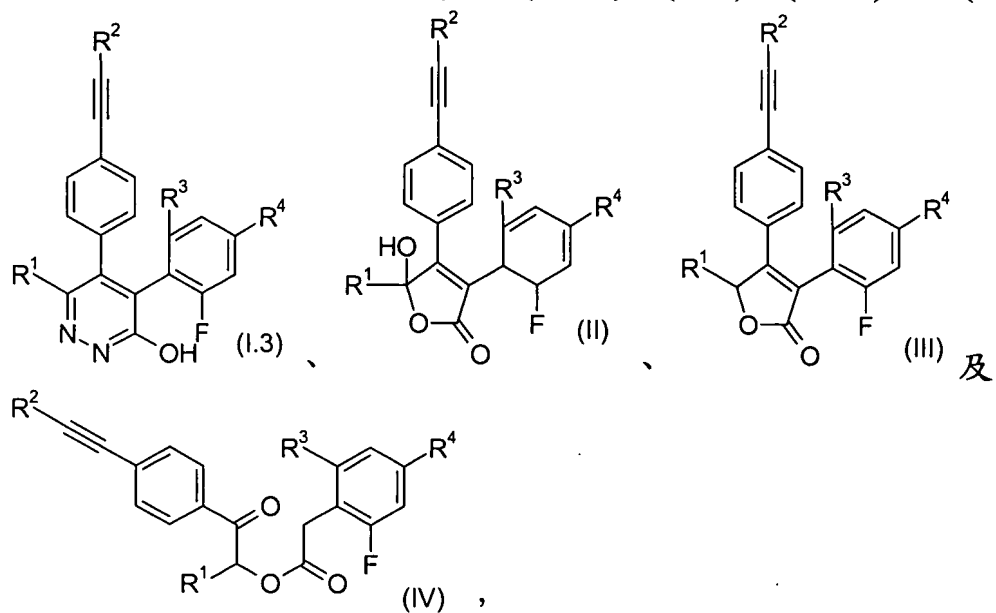
其中 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 係如申請專利範圍第 1 項中所定義。

八、圖式：

(無)

其中 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 係如申請專利範圍第 1 項中所定義。

13. 一種化合物，其係選自 (I.3)、(II)、(III) 及 (IV)：



其中 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 係如申請專利範圍第 1 項中所定義。

八、圖式：

(無)

四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：無。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

無

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

