

發明專利說明書

200521128

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號： 93/28655

※申請日期： 93.9.22

※IPC 分類：

C07D 487/04

A01N 43/90,

A01N 43/38

一、發明名稱：(中文/英文)

用於控制稻米病原菌之殺真菌混合物

FUNGICIDAL MIXTURES FOR CONTROLLING RICE PATHOGENS

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

德商巴地斯顏料化工廠

BASF AKTIENGESELLSCHAFT

代表人：(中文/英文)

1. 貝蕾爾

BIELLER

2. 寇斯特

KOESTER

住居所或營業所地址：(中文/英文)

德國來恩河勞域沙芬市卡羅玻斯克街

CARL-BOSCH-STRASSE, 67056 LUDWIGSHAFEN, GERMANY

國籍：(中文/英文)

德國 GERMANY

三、發明人：(共 6 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 喬狄 托默 I 布拉斯柯
BLASCO, JORDI TORMO I
2. 湯瑪士 葛洛帝
GROTE, THOMAS
3. 瑪麗亞 史奇勒
SCHERER, MARIA
4. 雷恩哈德 史堤爾
STIERL, REINHARD
5. 希格佛雷德 史揣斯曼
STRATHMANN, SIEGFRIED
6. 歐里齊 史丘佛
SCHOEFL, ULRICH

國 籍：(中文/英文)

1. 西班牙 SPAIN
2. 德國 GERMANY
3. 德國 GERMANY
4. 德國 GERMANY
5. 德國 GERMANY
6. 德國 GERMANY

四、聲明事項：

☐ 主張專利法第二十二條第二項 ☐ 第一款或 ☐ 第二款規定之事實，其事實發生日期為： 年 月 日。

☒ 申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

☒ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1. 德國；2003 年 09 月 22 日；10344147.6

2. 德國；2004 年 05 月 05 日；102004022684.9

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1.

2.

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

☐ 不須寄存生物材料者：

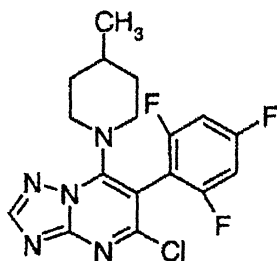
所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

九、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於控制稻米病原菌之殺真菌混合物，其包含一協同有效量之

1) 式I之三唑並嘓啶(triazolopyrimidine)

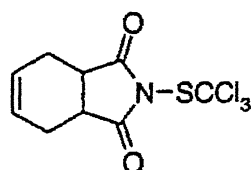


I

及

2) 一選自由下列組成之群組的鄰苯二醯亞胺衍生物II：

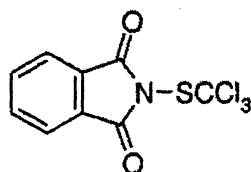
a) 式IIa之蓋普丹，



IIa

及

b) 式IIb之滅菌丹，



IIb

作為活性組份。

此外，本發明係關於一使用化合物I與化合物II之混合物控制稻米病原菌之方法且係關於化合物I與化合物II於製備該等混合物及含該等混合物之組合物中之用途。

【先前技術】

化合物I(即，5-氯-7-(4-甲基-六氫吡啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)-[1,2,4]三唑並[1,5-a]嘧啶)、其製備方法及其抗有害真菌之作用可自文獻(WO 98/46607)中獲知。

鄰苯二醯亞胺衍生物II(即，2-三氯甲硫基-3a,4,7,7a-四氫異吲哚基-1,3-二酮(Iia；常用名：蓋普丹)及2-三氯甲硫基異吲哚基-1,3-二酮(Iib；常用名：滅菌丹))之製備方法及其抗有害真菌之作用亦可自文獻(美國專利第2 553 770號、第2 553 771號、第2 553 776號)中獲知。該鄰苯二醯亞胺衍生物II長期以來在商業上一直作為主要抑制卵菌類的殺真菌劑出售。

三唑並嘧啶衍生物與蓋普丹之混合物概述於歐洲專利第EP-A 988 790號中。雖然該公開案之整體揭示內容包括化合物I，但並未明確提及之。故，化合物I與蓋普丹之組合係新穎的。在歐洲專利第EP-A 988 790號中未提到滅菌丹。

自歐洲專利第EP-A 988 790號中獲知之協同混合物被闡釋為具抗各種穀類、水果及蔬菜疾病(例如，小麥及大麥上之黴菌或蘋果上之灰色黴菌)之殺真菌活性。

然而，該等已知混合物的殺真菌作用並非總讓人完全滿意。

為了在盡可能低的施藥率下有效控制稻米病原體，本發明之一目的係提供若干雖然所施用活性化合物之總量降低但抗稻米病原菌之效用增強的混合物。

由於稻米栽培條件特殊，稻米殺真菌劑必須滿足之要求明顯不同於在穀類或水果生長中所用的殺真菌劑。其施用

方法存在差異：除了現代稻米栽培中常用的葉面施與外，該殺真菌劑通常在播種期間或之後不久即直接施於土壤上。殺真菌劑經由根吸收至植物體中並由植物體之液汁運輸至待保護的植物部分。相反，在穀類或水果生長中，殺真菌劑通常施用於葉片或果實上；故，在該等作物中，活性化化合物之內吸收作用的重要性明顯降低。

而且，稻米病原菌往往不同於穀類或水果中之病原菌。水稻稻瘟病菌(*Pyricularia oryzae*)及紋枯病菌(*Corticium sasakii*)(又名：立枯病菌(*Rhizoctonia solani*))係稻米中最主要的疾病之病原菌。立枯病菌係帽菌(*Agaricomycetidae*)亞綱中唯一在農業上具重要性的病原菌。該真菌並非象多數其他真菌一樣經由孢子而是經由一菌絲體侵襲植物體。

為此，在穀類或水果之栽培中關於殺真菌作用之研究結果不能轉用於稻類作物中。

農業實踐經驗已表明，在控制有害真菌中只重複應用個別專一活性化化合物在許多情況下會導致快速選擇出自然形成的或適應抵抗該活性化化合物的真菌菌株。故，用該活性化化合物有效控制該等真菌則不再具有可行性。

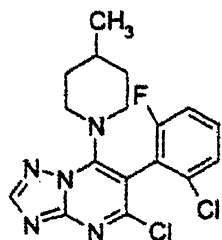
為減少有抵抗力的真菌菌株之選擇風險，現今較佳採用不同活性化化合物之混合物來控制有害真菌。藉由組合具有不同作用機制的化合物，可確保在一相對較長時期內之成功控制。

【發明內容】

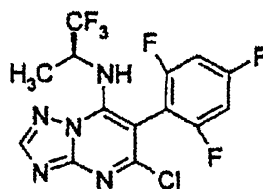
為了在盡可能低之施藥率下有效管控抵抗性及有效控制

稻米病原菌，本發明之一目的係提供若干雖然所施用活性化合物之總量降低但抗有害真菌之效用增強的混合物。

吾人已發現，該目的可藉由開篇處所定義之混合物達成。令人驚奇地，已發現根據本發明之三唑並嘧啶衍生物I與鄰苯二醯亞胺衍生物II之混合物抵抗稻米病原菌之活性遠遠強於歐洲專利第EP-A 988 790號揭示的結構類似的三唑並嘧啶A或B與蓋普丹之混合物。



A



B

而且，吾人已發現，以聯合方式或分開方式同時施用化合物I與任一化合物II或連續施用化合物I與任一化合物II較施用單獨的化合物對稻米病原性有害真菌具有更佳控制效果。

【實施方式】

當製備該等混合物時，較佳使用純活性化合物I及IIa或IIb，視需要可向其中添加其他抗有害真菌或其他害蟲(例如昆蟲、蜘蛛類動物或線蟲類動物)之活性化合物或添加可除草或調節生長之活性化合物或肥料。

特定言之，其他具上述含義之適宜殺真菌劑係選自下列群組之殺真菌劑：

- 醯基丙胺酸類，例如本達樂(benalaxyl)、右滅達樂(metalaxyl)、呋醯胺(ofurace)或惡霜靈(oxadixyl)，

- 胺衍生物類，例如阿迪嗎啉(aldimorph)、嗎菌靈(dodemorph)、芬普福(fenpropimorph)、苯鏽啖(fenpropidin)、雙胍辛胺(guazatine)、依米諾他定(iminoctadine)、司拜歐沙明(spiroxamine)或三得芬(tridemorph)，
- 苯胺並嘧啶類，例如嘧黴胺(pyrimethanil)、嘧菌胺(mepanipyrim)或嘧菌環胺(cyprodinyl)，
- 抗生素類，例如放線菌酮(cycloheximide)、灰黃黴素(griseofulvin)、春雷黴素(kasugamycin)、納他黴素(natamycin)、多抗黴素(polyoxin)或鏈黴素(streptomycin)，
- 吡咯類，例如比多農(bitertanol)、溴克唑(bromoconazole)、環克唑(cyproconazole)、待克利(difenoconazole)、二硝基克唑(dinitroconazole)、恩康唑(enilconazole)、依普唑(epoxiconazole)、芬克唑(fenbuconazole)、氟喹唑(fluquinconazole)、氟矽唑(flusilazole)、粉唑醇(flutriafol)、己唑醇(hexaconazole)、依滅列(imazalil)、依普克納唑(ipcanazole)、葉菌唑(metconazole)、腈菌唑(myclobutanil)、戊菌唑(penconazole)、普克利(propiconazole)、撲克拉(prochloraz)、撲托克唑(prothioconazole)、矽氟唑(simeconazole)、得克利(tebuconazole)、四克利(tetraconazole)、三唑酮(triadimefon)、三唑醇(triadimenol)、賽福唑(triflumizole)或滅菌唑(triticonazole)，
- 二羧甲醯亞胺類，例如撲海因(iprodione)、甲菌利(myclozolin)、腐黴利(procymidone)或免克寧(vinclozolin)，
- 二硫代胺基甲酸酯類，例如福美鐵(ferbam)、代森鈉

(nabam)、代森錳(maneb)、鋅錳乃浦(mancozeb)、威百畝(metam)、代森聯(metiram)、丙森鋅(propineb)、福代鋅(polycarbamate)、福美雙(thiram)、福美鋅(ziram)或代森鋅(zineb) ,

- 雜環化合物類，例如敵菌靈(anilazine)、苯菌靈(benomyl)、伯斯卡利得(boscalid)、多菌靈(carbendazim)、萎鏽靈(carboxin)、氧化萎鏽靈(oxycarboxin)、賽唑滅(cyazofamid)、棉隆(dazomet)、二噻農(dithianon)、凡殺同(famoxadone)、咪唑菌酮(fenamidone)、芬瑞莫(fenarimol)、麥穗寧(fuberidazole)、福多寧(flutolanil)、福拉比(furametpyr)、稻瘟靈(isoprothiolane)、滅普寧(mepronil)、尼瑞莫(nuarimol)、啖苯甲醯胺(picobenzamide)、噻菌靈(probenazole)、普喹疊氮(proquinazid)、比芬諾(pyrifenox)、百快隆(pyroquilon)、快諾芬(quinoxyfen)、矽托凡(silthiofam)、涕必靈(thiabendazole)、賽氟滅(thifluzamide)、托布津(thiophanate-methyl)、他得寧(tiadinil)、三賽唑(tricyclazole)或賽福寧(triforine) ,
- 含銅之殺真菌劑類，例如波爾多(Bordeaux)混合劑、醋酸銅、氯氧化銅或鹼式硫酸銅，
- 硝基苯衍生物類，例如，樂殺蟎(binapacryl)、敵蟎普(dinocap)、敵蟎通(dinobuton)或硝基酞-異丙基，
- 苯基吡咯類，例如拌種咯(fenpiclonil)或賽普護汰寧(fludioxonil),
- 硫，

- 其他殺真菌劑，例如 S-甲基-阿斯苯唑(acibenzolar-S-methyl)、苯噻菌胺(benthiavalicarb)、加普胺(carpropamid)、百菌清(chlorothalonil)、賽氟咪唑(cyflufenamid)、克絕(cymoxanil)、達滅淨(diclomezine)、迪多賽米(diclocymet)、萬德靈(diethofencarb)、克瘟散(edifenphos)、斯波西(ethaboxam)、環醯菌胺(fenhexamid)、薯瘟錫(fentin acetate)、凡諾克寧(fenoxanil)、富米綜(ferimzone)、氟啞胺(fluzinam)、福賽得(fosetyl)、三乙磷酸鋁(fosetyl-aluminum)、顯德威(iprovalicarb)、六氯苯、米特拉芬酮(metrafenone)、賓克隆(pencycuron)、普拔克(propamocarb)、熱必斯(phthalide)、甲基立枯磷(tolclofos-methyl)、五氯硝基苯或氯苯醯胺，
- 嗜穗果傘素(strobilurin)類，例如腈嘧菌酯(azoxystrobin)、地莫昔賓(dimoxystrobin)、氟氧菌酯(fluxastrobin)、克收欣(kresoxim-methyl)、苯氧菌胺(metominostrobin)、奧沙菌酯(orysastrobin)、啞氧菌酯(picoxystrobin)、百克敏(pyraclostrobin)或三氟敏(trifloxystrobin)，
- 次磺酸衍生物類，例如四氯丹(captafol)、抑菌靈(dichlofluanid)或對甲抑菌靈(tolyfluanid)，
- 肉桂醯胺及類似化合物類，例如達滅芬、氟滅歐(flumetover)或氟嗎啉。

在根據本發明之混合物之一具體實施例中，係將另一殺真菌劑III或另兩種殺真菌劑III及IV添加至化合物I及II中。

較佳者係化合物I及II與一組份III之混合物。尤其較佳者係化合物I及IIa或IIb之混合物。

化合物I與II之混合物，或同時(即，以聯合方式或分開方式)使用的化合物I與化合物II，展示出顯著的抗子囊菌類(*Ascomycetes*)、半知菌類(*Deuteromycetes*)及擔子菌類(*Basidiomycetes*)中之稻米病原菌的作用。其可用於處理種子以及用作可作用於葉片及土壤之殺真菌劑。

其對於控制稻米植株及其種子上之有害真菌(例如平臍蠕孢屬(*Bipolaris*)及內臍蠕孢屬(*Drechslera*)及水稻稻瘟病)特別重要。其特別適用於控制由水稻稻瘟病菌引起的稻米枯萎。

另外，根據本發明的化合物I及II之組合亦適用於控制其它病原菌，例如，穀類上之殼針孢黴菌(*Septoria*)及柄鏽菌(*Puccinia*)及蔬菜、水果及葡萄藤上之鏈格菌(*Alternaria*)及灰黴菌(*Botrytis*)。

其亦可用於材料保護中(例如，保護木材)，例如用來防禦擬青黴(*Paecilomyces variotii*)。

化合物I與化合物IIa或IIb可同時(即，以聯合方式或分開方式)施用或連續施用；若以分開方式施用，則施用順序一般不會對控制措施之結果產生任何影響。

化合物I與化合物IIa及IIb之施用重量比一般介於100:1至1:100之間，較佳介於10:1至1:50之間，尤其是介於5:1至1:20之間。

端視化合物類型及所需效應而定，根據本發明之混合物

之施藥率介於5克/公頃至2000克/公頃之間，較佳介於50至1500克/公頃之間，尤其是介於50至1000克/公頃之間。

因此，化合物I之施藥率一般介於1至1500克/公頃之間，較佳介於10至1200克/公頃之間，尤其是介於20至900克/公頃之間。

相應地，化合物IIa或IIb之施藥率一般介於1至2000克/公頃之間，較佳介於10至1500克/公頃之間，尤其是介於20至1000克/公頃之間。

在處理種子時，混合物之施藥率一般介於1至1000克/100公斤種子之間，較佳介於1至200克/100公斤種子之間，尤其是介於5至100克/100公斤種子之間。

在控制其係稻米病原菌之有害真菌時，可在植物播種前後或植物萌發前後藉由在種子、秧苗、植株上或土壤中噴或撒化合物I及化合物IIa或IIb或化合物I與化合物IIa或IIb之混合物之方式進行分開或聯合施用。該等化合物之施用較佳藉由聯合地或分別地噴灑葉片來實施。該等化合物之施用亦可藉由施用顆粒或藉由噴撒於土壤來實施。

根據本發明之混合物或化合物I及II可轉化成習知調配物，例如溶液、乳液、懸浮液、粉劑、粉末、膏糊及顆粒。施用形式端視特定目的而定；在任一狀況下，均應確保本發明之化合物得到較佳而均勻的分佈。

調配物可以一習知方式製備，舉例而言藉由用溶劑及/或載劑來摻雜活性化合物，若需要，可使用乳化劑及分散劑。合適之溶劑/輔料主要包括：

- 水、芳族溶劑(舉例而言 Solvesso 產品、二甲苯)、石蠟(例如礦物組分)、醇類(例如甲醇、丁醇、戊醇、苯甲醇)、酮類(例如環己酮、 γ -丁內酯)、吡咯烷酮(NMP、NOP)、醋酸酯(乙二醇二乙酸酯)、乙二醇、脂肪酸二甲基鹽胺、脂肪酸及脂肪酸酯。原則上，亦可使用溶劑混合物，
- 載劑，例如經研磨之天然礦物質(例如高嶺土、黏土、滑石、白堊)及經研磨之合成礦物質(例如高分散矽石、矽酸鹽)；乳化劑，例如非離子型及陰離子型乳化劑(例如聚環氧乙烷脂肪醇醚、烷基磺酸鹽及芳基磺酸鹽)；及分散劑，例如木質素亞硫酸鹽廢液及甲基纖維素。

適合之表面活性劑係木質素磺酸、萘磺酸、酚基磺酸、二丁基萘磺酸、烷基芳基磺酸酯、硫酸烷酯、磺酸烷酯、脂肪醇硫酸酯、脂肪酸及經硫酸化之脂肪醇乙二醇醚之鹼金屬、鹼土金屬及銨鹽；此外還有：經磺酸化之萘及萘衍生物與甲醛之縮合物；萘或萘磺酸與苯酚及甲醛之縮合物；聚環氧乙烷辛苯基醚、經乙氧基化之異辛基苯酚、辛基苯酚、壬基苯酚、烷基苯基聚乙二醇醚、三丁苯基聚乙二醇醚、三硬脂鹽苯基聚乙二醇醚、烷基芳基聚醚醇、醇及脂肪醇/氧乙烯縮合物；經乙氧基化之蓖麻油；聚環氧乙烷烷基醚；經乙氧基化之聚環氧丙烷；月桂鹽聚乙二醇醚縮醛；山梨醇酯；木質素亞硫酸鹽廢液及甲基纖維素。

適於製備可直接噴灑之溶液、乳液、膏糊或油分散液之

物質係具中至高沸點之礦物油餾分，例如，煤油或柴油；以及煤焦油及植物油或動物油；脂肪烴、環烴及芳烴，例如，甲苯、二甲苯、石蠟、四氫化萘、烷基化萘或其衍生物；甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、環己醇、環己酮、異佛爾酮；強極性溶劑，例如，二甲基亞砷、N-甲基吡咯烷酮及水。

粉末，即用於噴施及可撒施產品之物質，可藉由用一固體載劑混合或同時研磨活性物質製備。

顆粒(例如，經塗布之顆粒、經灌注之顆粒及均質顆粒)可藉由將活性化合物結合至固體載劑製備。固體載劑之實例係礦物土，例如矽膠、矽酸鹽、雲母、高嶺土、美國活性白土(attaclay)、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、經研磨之合成礦物質；肥料，例如，硫酸銨、磷酸銨、硝酸銨、尿素及植物產品，例如，穀類粗粉、樹皮粗粉、木粉及堅果殼粗粉、纖維素粉末及其它固體載劑。

一般言之，調配物包含介於0.01至95重量%間且較佳介於0.1至90重量%間之活性化合物。所用活性化合物之純度介於90%至100%之間，較佳介於95%至100%之間(根據NMR譜)。

下文為調配物之實例：1.待用水稀釋之產品

A)水溶性濃縮物(SL)

將10重量份活性化合物溶於水或一水溶性溶劑中。作為一替代方案，可添加潤濕劑或其它輔料。用水稀釋時，活

性化合物溶解。

B)可分散之濃縮物(DC)

將20重量份活性化合物溶於環己酮中並添加一分散劑(例如聚乙烯吡咯烷酮)。用水稀釋可獲得一分散液。

C)可乳化之濃縮物(EC)

將15重量份活性化合物溶於二甲苯中並添加十二烷基苯磺酸鈣及乙氧基化蓖麻油(在每一情況下濃度皆係5%)。用水稀釋可獲得一乳液。

D)乳液(EW、EO)

將40重量份活性化合物溶於二甲苯中並添加十二烷基苯磺酸鈣及乙氧基化蓖麻油(在每一情況下濃度皆係5%)。藉由一乳化劑(Ultraturax)將該混合物引入水中，製成一均質乳液。用水稀釋得到一乳液。

E)懸浮液(SC、OD)

在一攪拌球磨機中，將20重量份活性化合物粉碎並添加分散劑、潤濕劑及水或一有機溶劑以獲得一高質量之活性化合物懸浮液。用水稀釋可獲得活性化合物之一穩定懸浮液。

F)可水分散性顆粒及水溶性顆粒(WG、SG)

將50重量份活性化合物研磨成細粒並添加分散劑及潤濕劑，且藉由工藝裝置(舉例而言擠壓機、噴霧塔、流化床)製成可水分散性或水溶性顆粒。用水稀釋可獲得活性化合物的一穩定分散液或溶液。

G)可水分散性粉末及水溶性粉末(WP、SP)

將75重量份活性化合物於一轉子-定子研磨機中研磨並添加分散劑、潤濕劑及矽膠。用水稀釋可獲得活性化合物的一穩定分散液或溶液。

2. 無需稀釋即可使用的產品

H) 可撒施之粉末 (DP)

將5重量份活性化合物研磨成細粉並與95%之微細高嶺土充分混合。由此獲得一可撒施產品。

I) 顆粒 (GR、FG、GG、MG)

將0.5重量份活性化合物研磨成細粒並與95.5%之載劑結合。目前之方法係擠壓、噴霧乾燥或使用流化床。由此獲得無需稀釋即可施用之顆粒。

J) ULV 溶液 (UL)

將10重量份活性化合物溶於一有機溶劑(例如二甲苯)中。由此獲得一無需稀釋即可施用之產品。

根據其調配物形式或所製備之使用形式，例如，可直接噴灑之溶液、粉末、懸浮液或分散液、乳液、油分散液、膏糊、可灑施產品、用於撒布之物質或顆粒等形式，活性化合物可藉由噴灑、噴霧、噴撒、撒布或澆注等方式施用。使用方式完全視預期目的而定；意在確保在任一狀況下本發明之活性化合物皆能得到可能的最佳分佈。

水性使用形式可藉由添加水而自乳液濃縮物、膏糊或可潤濕性粉末(可噴灑之粉末、油分散液)來製備。為製備乳液、膏糊或油分散液，原狀態或溶於一油或溶劑中之物質可藉由一潤濕劑、增黏劑、分散劑或乳化劑於水中均質化。

另外，可製備由活性物質、潤劑濕、增黏劑、分散劑或乳化劑及(若合適)溶劑或油組成之濃縮物，該等濃縮物適於用水稀釋。

即用製劑中活性化合物之濃度可在相當寬廣的範圍內變化。一般言之，其可介於0.0001至10%之間，較佳介於0.01至1%之間。

活性化合物亦可成功地用於超低量方法(ULV)中，有可能施用包含超過95重量%的活性化合物之調配物，或甚至施用不含添加劑之活性化合物。

若適宜，可在使用(罐混合)前於活性化合物中添加各種類型之油、潤濕劑、佐劑、除草劑、殺真菌劑、其他殺蟲劑或殺菌劑。該等試劑通常以一介於1:10至10:1間之重量比與本發明之試劑混合。

藉由使用殺真菌有效量之混合物或在分開施用之狀況下藉由使用殺真菌有效量之化合物I及II處理有害真菌或處理欲免受其侵害的植株、種子、土壤、面積、材料或空間來施用化合物I及II或其混合物或相應之調配物。施用可於被有害真菌感染之前或之後實施。

化合物及混合物之殺真菌作用可經由以下實驗闡釋：

將活性化合物(以分開或聯合方式施用)製備成一於丙酮或DMSO中溶解有0.25重量%活性化合物之原液。將1重量%之乳化劑Uniperol® EL(以乙氧基化烷基酚為主的具乳化及分散作用之潤濕劑)加至該溶液中，並用水將該溶液稀釋至所需濃度。

應用實例-防止藉由水稻稻瘟病菌所引起之稻米枯萎的保護性活性

使用一具有下述活性化合物濃度之水性懸浮液噴灑盆植品種「泰農67(Tai-Nong 67)」稻米秧苗的葉子至懸浮液自植株葉面向下滾落。第二天，用一水稻稻瘟病菌之水性孢子懸液對該等植物實施接種。然後將該等測試植物置於一溫度為22-24℃且相對空氣濕度為95-99%的人工氣候室中6天。然後目測確定該等葉片上之感染發展程度。

將該受感染葉片面積之目測百分比數值轉化成未經處理的對照組之百分比效力：

如下使用 Abbot公式計算效力(E)：

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

α 係經處理植株之真菌感染百分數，且

β 係未經處理(對照)植株之真菌感染百分數

效力為0意指經處理植株之感染程度等於未經處理之對照植株之感染程度；效力為100意指經處理植物未受感染。

活性化合物之混合物的預期效力可使用 Colby公式(Colby, S.R. "Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide combinations", Weeds 15, 20-22, 1967)確定並將其與所觀測到之效力予以比較。

Colby公式：

$$E=x+y-x\cdot y/100$$

E 當使用活性化合物A及B(濃度為a及b)之混合物時用未經處理的對照試樣之百分數表示的預期效力

x 當使用濃度為a之活性化合物A時用未經處理的對照試樣之百分數表示的效力

y 當使用濃度為b之活性化合物B時用未經處理的對照試樣之百分數表示的效力

所用對照化合物係化合物A及B，已知歐洲專利第EP-A 988 790號中所述之蓋普丹混合物中含有此等化合物：

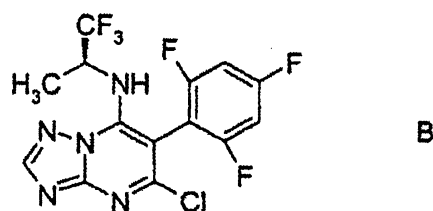
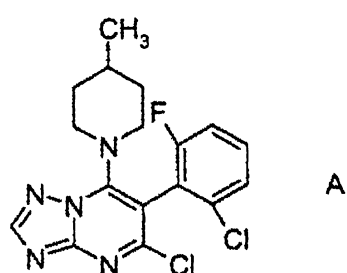


表 A-個別活性化合物

實例	活性化合物	噴霧溶液中活性化合物之濃度[ppm]	用未經處理的對照試樣之百分數表示之效力
1	-	對照試樣(未經處理)	(76%感染)
2	I	63 16	48 21
3	IIa (蓋普丹)	63 16	35 0
4	IIb (滅菌丹)	63 16	8 0
5	對照化合物A	63 16	61 35
6	對照化合物B	63 16	61 48

表 B-根據本發明之混合物

實例	活性化合物之混合物 ；濃度；混合比	所觀測到的效力	計算所得的效力*)
7	I+IIa 63+16 ppm 4:1	91	48
8	I+IIa 16+63 ppm 1:4	87	49
9	I+IIb 63+16 ppm 4:1	80	48
6	I+IIb 16+63 ppm 1:4	74	28

*) 使用 Colby 公式計算所得效力

表 C-對照實驗-歐洲專利第 EP-A 988 790 號中提及之活性化合物的組合

實例	活性化合物之混合物 ；濃度；混合比	所觀測到的效力	計算所得的效力*)
11	A+IIa 63+16 ppm 4:1	61	61
12	A+IIa 16+63 ppm 1:4	35	57
13	A+IIb 63+16 ppm 4:1	48	61
14	A+IIb 16+63 ppm 1:4	35	40
15	B+IIa 63+16 ppm 4:1	48	61

16	B+IIa 16+63 ppm 1:4	35	66
17	B+IIb 63+16 ppm 4:1	48	61
18	B+IIb 16+63 ppm 1:4	48	52

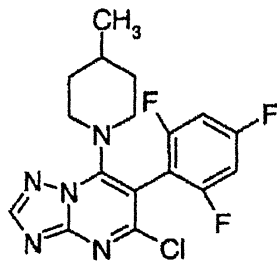
★) 使用 Colby 公式計算所得效力

測驗結果表明，根據本發明之混合物在可比較施用率下具有較歐洲專利第 EP A 988 790 號之蓋普丹混合物顯著更強之活性，即便是作為單獨活性化合物的相當化合物，亦較化合物 I 具更強活性。

五、中文發明摘要：

本發明闡述了用於控制稻米病原菌之殺真菌混合物，該混合物包含協同有效量之

1) 式I之三唑并嘧啶 (triazolopyrimidine)

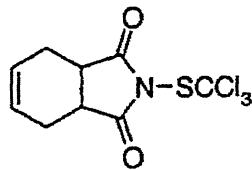


I

及

2) 一選自由下列組成之群組的鄰苯二甲醯亞胺衍生物II：

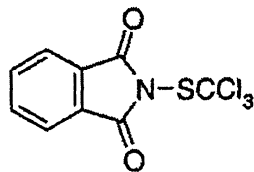
a) 式IIa之蓋普丹(captan)，



IIa

及

b) 式IIb之滅菌丹(folpet)，



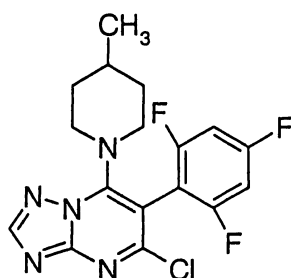
IIb

作為活性組份；本發明亦闡述了使用化合物I與化合物II之混合物控制稻米病原菌之方法，及化合物I與化合物II於製備該等混合物及含該等混合物之組合物中之用途。

六、英文發明摘要：

Fungicidal mixtures for controlling rice pathogens, which mixtures comprise, as active components,

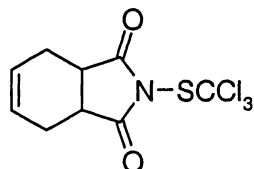
- 1) the triazolopyrimidine derivative of the formula I,



and

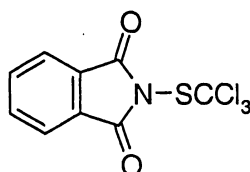
- 2) a phthalimide derivative II selected from the group consisting of

- a) captan of the formula IIa,



and

- b) folpet of the formula IIb,

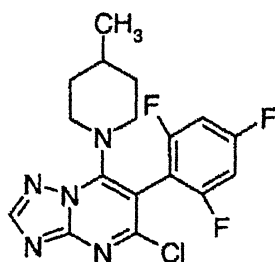


in a synergistically effective amount, methods for controlling rice pathogens using mixtures of the compound I with the compounds II, the use of the compound I with the compounds II for preparing such mixtures and compositions comprising these mixtures are described.

十、申請專利範圍：

1. 一種用於控制稻米病原菌之殺真菌混合物，其包含協同有效量之

- 1) 式I之三唑并嘧啶衍生物

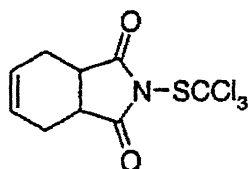


I

及

- 2) 一鄰苯二甲醯亞胺衍生物II，其選自由下列組成之群組：

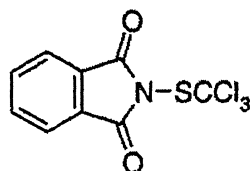
- a) 式IIa之蓋普丹(captan)，



IIa

及

- b) 式IIb之滅菌丹(folpet)，



IIb

2. 如請求項1之殺真菌混合物，其以100:1至1:100的重量比包含該式I化合物及該式II化合物。
3. 如請求項1或2之殺真菌混合物，其包含作為鄰苯二甲醯亞胺衍生物的如請求項1之該式IIa之蓋普丹。

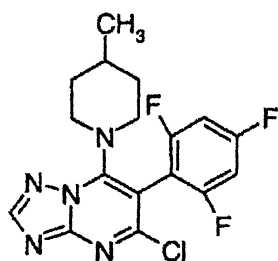
4. 如請求項1或2之殺真菌混合物，其包含作為鄰苯二甲醯亞胺衍生物的如請求項1之該式IIb之滅菌丹。
5. 一種殺真菌組合物，其包含一液體或固體載劑及一如請求項1至4中任一項之混合物。
6. 一種用於控制稻米病原菌性有害真菌之方法，其包括使用有效量之如請求項1之化合物I及該等化合物II之一處理該真菌、其寄生地或欲免受真菌侵害之植物、土壤或種子。
7. 如請求項6之方法，其中如請求項1之該化合物I及II係以聯合方式或分開方式同時施用或連續施用。
8. 如請求項6之方法，其中如請求項1至4中任一項之該混合物係以5克/公頃至2000克/公頃之量施用。
9. 如請求項6或7之方法，其中如請求項1至4中任一項之該混合物係以1至1000克/100公斤種子之量施用。
10. 如請求項6至8中任一項之方法，其中係控制有害真菌水稻稻瘟病菌(*Pyricularia oryzae*)。
11. 一種種子，其包含用量為1至1000克/100公斤種子之如請求項1至4中任一項之該混合物。
12. 一種利用如請求項1之化合物I及化合物II於製備適於控制有害真菌之組合物之用途。

七、指定代表圖：

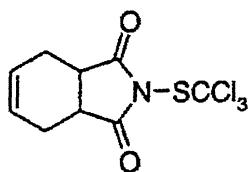
(一)本案指定代表圖為：(無)

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

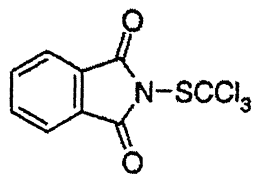


I



IIa

及



IIb