

5. 姓 名：(中文/英文) 吉田 真子 / YOSHIDA, MASAKO

國 籍：(中文/英文) 日本 / JAPAN

6. 姓 名：(中文/英文) 長田 悠子 / OSADA, YUKO

國 籍：(中文/英文) 日本 / JAPAN

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. 受理國家(地區)：日本 JP

申請日期：2003 年 10 月 31 日

申請案號：特願 2003-372467

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

☐ 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。

5. 姓 名：(中文/英文) 吉田 真子 / YOSHIDA, MASAKO

國 籍：(中文/英文) 日本 / JAPAN

6. 姓 名：(中文/英文) 長田 悠子 / OSADA, YUKO

國 籍：(中文/英文) 日本 / JAPAN

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. 受理國家(地區)：日本 JP

申請日期：2003 年 10 月 31 日

申請案號：特願 2003-372467

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

☐ 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】

本發明與新穎二胺衍生物與其製造方法及以此等二胺衍生物為有效成分之植物病害防治劑有關。

【先前技術】

病蟲害防治在水稻栽培所擔任之任務甚大，尤其水稻稻熱病為其重要病害而已有各種植物病害防治劑被研發、應用。但在植物病害防治活性及對有用作物之藥害方面而言尚未必能令人十分滿意。又近年來由於植物病害防治劑之大量使用導致出現對藥劑具抗藥性之菌種，使現有藥劑無法充分表現其殺菌活性。由上述觀點極需能夠以低濃度防治有害菌之新植物病害防治劑。又，於特開 2003 - 096046 號公報提示與本發明之化合物不同之二胺衍生物及以此等二胺衍生物為有效成分之植物病害防治劑。但於該公報中，關於含有具被鹵素所取代烴基之羥羰基之二胺衍生物之有用性並無任何記載。

專利文獻 1：特開 2003 - 096046 號公報(WO2003008372)

【發明內容】

本發明以提供對水稻稻熱病表現優異防治效果之二胺衍生物為目的。

此次，本發明者等發現在二胺衍生物中尤其以含有具被鹵素所取代烴基之羥羰基之二胺衍生物對水稻稻熱病表現優異防治效果。同時發現其防治效果顯著較特開 2003 - 096046 號公報所提示之其他二胺衍生物所得效果優異，乃完成本發明。

本發明即如下述。

[1] 一種二胺衍生物，其特徵為以化學式(1)表示：

至於1~6個碳原子之烴基，如甲基、乙基、丙基、丁基、戊基、己基、環丙基、環丁基、環戊基、環己基、乙烯基、丙烯基、丁烯基、戊烯基、己烯基、環丙烯基、環丁烯基、環戊烯基、環己烯基、乙炔基、丙炔基、丁炔基、戊炔基、己炔基、苯基、萘基等，雜芳基如吡啶基、嘧啶基、噻吩基、呋喃基、吡唑基、咪唑基、異噻唑基、異𪔐唑基、𪔐𪔐基、喹啉基、苯並呋喃基、苯並噻吩基、苯並𪔐唑基、苯並異𪔐唑基、苯並咪唑基、苯並噻唑基、苯並異噻唑基等，醯基如乙醯基等之烷羧基或苯醯基等之芳羧基等，芳基及雜芳基之取代基如甲基、乙基、丙基、丁基等烷基，環丙基、環丁基、環戊基、環己基等環烷基，三氟甲基、二氟甲基、溴二氟甲基、三氟乙基等鹵素取代烷基，甲氧基、乙氧基、丙氧基、丁氧基等烷氧基，三氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟乙氧基等鹵素取代烷氧基，甲氧羰基、乙氧羰基、丙氧羰基、丁氧羰基等烷氧羰基，苯氧羰基等芳氧羰基，甲氨基、乙氨基、丙氨基、丁氨基、二甲氨基等烷基氨基，環丙氨基、環丁氨基、環戊氨基、環己氨基、二環丙氨基等環烷基氨基，甲基氨基甲醯、乙基氨基甲醯、丙基氨基甲醯、丁基氨基甲醯、二甲基氨基甲醯等烷基氨基甲醯基，環丙基氨基甲醯、環丁基氨基甲醯、環戊基氨基甲醯、環己基氨基甲醯、二環丙基氨基甲醯等環烷基氨基甲醯基，甲羰氨基、乙羰氨基、丙羰氨基、丁羰氨基等烷羰氨基，環丙羰氨基、環丁羰氨基、環戊羰氨基、環己羰氨基等環烷羰氨基，甲氧羰氨基、乙氧羰氨基、丙氧羰氨基、丁氧羰氨基等烷氧羰氨基，環丙氧羰氨基、環丁氧羰氨基、環戊氧羰氨基、環己氧羰氨基等環烷氧羰氨基，甲硫基、乙硫基、丙硫基、丁硫基等烷基硫基，三氟甲硫基、二氟甲硫基、三氟乙硫基等鹵素取代烷基硫基，甲亞磺醯基、乙亞磺醯基、丙亞磺醯基、丁亞磺醯基等烷亞磺醯基，三氟甲亞磺醯基、二氟甲亞磺醯基、三氟乙亞磺醯基等鹵素取代烷亞磺醯基，甲磺醯基、乙磺醯基、丙磺醯基、丁磺醯基等烷磺醯基，三氟甲磺醯基、二氟甲磺醯基、三氟乙磺醯基等鹵素取代烷磺醯基，甲磺醯胺基、乙

可當做溶劑使用。

至於在以反應式(1)表示之反應中所使用之溶劑，只要不與以化學式(1)、化學式(2)及化學式(3)表示之化合物反應，可使用如水，二氯甲烷、氯仿等鹵化烴化合物，苯、甲苯、二甲苯等芳香族烴化合物，己烷、庚烷等脂肪族烴化合物，二甲基甲醯胺(DMF)、二甲基乙醯胺(DMA)、二甲亞砜(DMSO)、1,3-二甲基-2-咪唑二酮(DMI)、1-甲基-2-吡咯酮(NMP)等非質子性極性溶劑，二乙醚、異丙醚、1,2-二甲氧基乙烷(DME)、四氫扶喃(THF)、二噁烷等醚類，乙腈、丙腈等腈類。

以化學式(3)表示之羰基化合物對以化學式(2)表示之化合物之當量以1~2當量較好，1~1.2當量更好。

上述反應之反應溫度與反應時間可在較大範圍內改變。通常，反應溫度以-20~200℃較好，0~100℃更好；反應時間以0.01~50小時較好，0.1~15小時更好。

在反應式(1)中以化學式(2)表示之二胺衍生物或其鹽除市售品以外，亦可依加柏利(Gabriel)合成法，茛二醇法，將氰基或醯胺、亞胺、肟(oxime)等還原之習知胺合成法，或 Tetrahedron Asymmetry 第11卷、第1907頁(2000年)所記述方法簡單製造之。

在反應式(1)中以化學式(3)表示之化合物，可依常法將以化學式(4)表示之習知羧酸衍生物與亞硫醯氯、噁唑氯、光氯(即二氯化碳醯)、碳醯磷、三氯化磷、五氯化磷、亞硫醯溴、三溴化磷、二乙氨基三氯化硫、1,1-羰基雙-1H-咪唑等進行反應製造之。

在反應式(1)中以化學式(3)表示之化合物，亦可依常法將以化學式(4)表示之習知羧酸衍生物與甲醇、乙醇等醇類或苯酚、硝基苯等苯酚類進行反應製造之。

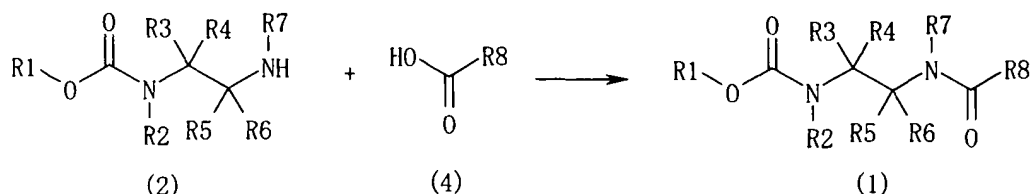
在反應式(1)中以化學式(3)表示之化合物，亦可依常法將以化學式(4)表示之習知羧酸衍生物與氯甲酸甲酯、氯甲酸苯酯等氯甲酸酯類進行反應製造之。

在反應式(1)中以化學式(3)表示之化合物，亦可依常法將以

化學式(4)表示之習知羧酸衍生物與 N-羥基琥珀酸亞胺、1-羥基苯並三唑等進行反應製造之。

以化學式(1)表示之本發明之化合物，亦可依反應式(2)所記述方法製造之。

反應式(2)



[式中，R1、R2、R3、R4、R5、R6 及 R7 與上述以化學式(2)表示之化合物所定義相同，R8 則與上述以化學式(4)表示之化合物所定義相同]。

在反應式(2)，將化學式(2)表示之二胺衍生物或其鹽與化學式(4)表示之習知羧酸衍生物於無溶劑或溶劑中進行縮合，製造以化學式(1)表示之二胺衍生物。

此時之縮合劑可使用 N,N-二環己基碳化二亞胺、1,1-羰基雙-1H-咪唑、1-乙基-3-(3-二甲胺丙基)碳化二亞胺·鹽酸鹽、2-氯-1,3-二甲基咪唑氯等。

縮合劑使用量為對以化學式(4)表示之化合物之 1~2 當量較好，1~1.2 當量更好。

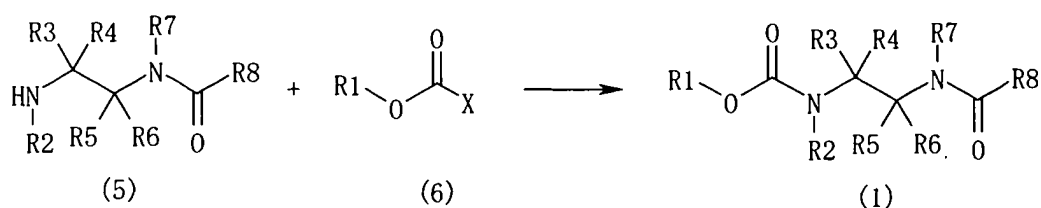
又此時所使用之有機溶劑，只要不與以化學式(1)、化學式(2)及化學式(4)表示之化合物反應，可使用與在反應式(1)所示方法中所使用之相同有機溶劑。

以化學式(4)表示之羧酸衍生物使用量為對以化學式(2)表示之二胺衍生物之 1~2 當量較好，1~1.2 當量更好。

上述反應之反應溫度與反應時間可在較大範圍內改變。通常，反應溫度以 -20~200℃ 較好，0~100℃ 更好；反應時間以 0.01~50 小時較好，0.1~15 小時更好。

以化學式(1)表示之本發明之化合物，亦可依反應式(3)所記述方法製造之。

反應式(3)



[式中，R2、R3、R4、R5、R6、R7及R8與上述以化學式(5)表示之化合物所定義相同，R1及X則與上述以化學式(6)表示之化合物所定義相同]。

在反應式(3)，將化學式(5)表示之二胺衍生物或其鹽與化學式(6)表示之習知化合物於無溶劑或溶劑中、無鹼類或鹼類存在下進行反應，製造以化學式(1)表示之二胺衍生物。

反應式(3)中之以化學式(6)表示之化合物，可依常法將其所對應醇類與光氣、三光氣等光氣類或氯甲酸苯酯等氯甲酸酯類進行反應製造之。

又，此時鹼類可使用與在反應式(1)所示方法中所使用之相同鹼類。

此等鹼類之使用量並無特別限制，如使用上述之有機鹼類時亦可當做溶劑使用。

又，此時所使用之有機溶劑，只要不與化學式(1)、化學式(5)及化學式(6)表示之化合物反應，可使用與在反應式(1)所示方法中所使用之相同有機溶劑。

以化學式(6)表示之化合物使用量為對以化學式(5)代表之二胺衍生物之1~4當量較好，1~2當量更好。

上述反應之反應溫度與反應時間可在較大範圍內改變。通常，反應溫度以-20~200℃較好，0~100℃更好；反應時間以0.01~50小時較好，0.1~15小時更好。

以化學式(1)表示之二胺衍生物，因取代基種類而存在不對稱碳原子，因此可能以旋光異構體、非對映立體異構體、外消旋體及此等之任意比例之混合物狀態存在。本發明均包含此等所有異構體及其混合物。

含有本發明之化合物、即以化學式(1)表示之二胺衍生物為有效成分之植物病害防治劑對水稻稻熱病(*Pyricularia oryzae*)等表現優異之防治效果。

本發明之化合物、即以化學式(1)表示之二胺衍生物當然可與其他植物病害防治劑、殺蟲劑、殺草劑、植物生長調節劑等農藥、土壤改良劑或肥效性物質等混合使用，並亦可製成與此等之混合製劑。

本發明之化合物可直接使用，但以與包含固體或液體稀釋劑之載體混合而成之組成物形態施用較好。在此所謂載體即指幫助有效成分到達處理部位，或為容易操作有效成分化合物之貯藏、輸送而配合之合成或天然無機或有機物質。

適合之固體載體可舉例如蒙脫石、高嶺土、膨潤土等黏土類，矽藻土、白土、滑石、蛭石、石膏、碳酸鈣、矽膠、硫安等無機物質，黃豆粉、鋸屑、小麥粉等植物性有機物質及尿素等。

適合之液體載體可舉例如甲苯、二甲苯、異丙苯等芳香族烴化合物，煤油、礦油等石蜡類烴化合物，四氯化碳、氯仿、二氯乙烷等鹵素類烴化合物，丙酮、甲乙酮等酮類，二噁烷、四氫呋喃、二甘醇二甲基醚等醚類，甲醇、乙醇、丙醇、乙二醇等醇類，二甲基甲醯胺、二甲亞砷、1-甲基-2-吡咯酮等非質子性極性溶劑及水等。

再者，為增強本發明之化合物之效力，考慮製劑劑型或應用場合，而因應目的可單獨或組合使用下列輔助劑。

輔助劑以乳化、分散、擴散、濕潤、黏合及安定化等目的而可舉例如木質磺酸鹽(酯)、烷基苯磺酸鹽(酯)、烷基硫酸酯、聚氧化烯烷基硫酸(鹽)酯、聚氧化烯烷基磷酸鹽(酯)等陰離子界面活性劑，聚氧化烯烷基醚、聚氧化烯烷基芳基醚、聚氧化烯烷基胺、聚氧化烯烷基醯胺、聚氧化烯烷基硫基醚、聚氧化烯脂肪酸酯、甘油脂肪酸酯、山梨糖醇酐脂肪酸酯、聚氧化環烯山梨糖醇酐脂肪酸酯、聚氧化丙烯聚氧化乙烯成塊聚合物等非離子性界面活性

劑，硬脂酸鈣、蠟等潤滑劑，異丙基磷酸氫等安定劑，及其他甲基纖維素、羧甲基纖維素、酪蛋白、阿拉伯膠等。但此等成分並不限定如上述者。

本發明之化合物之有效成分量通常在粉劑為 0.5~20 重量%，乳劑為 5~50 重量%，可濕性粉劑為 10~90 重量%，粒劑為 0.1~20 重量%，水懸粉劑為 10~90 重量%。另一方面，上述各劑型所含載體量通常在粉劑為 60~99 重量%，乳劑為 40~95 重量%，可濕性粉劑為 10~90 重量%，粒劑為 80~99 重量%，水懸粉劑為 10~90 重量%。又，輔助劑含量通常在粉劑為 0.1~20 重量%，乳劑為 1~20 重量%，可濕性粉劑為 0.1~20 重量%，粒劑為 0.1~20 重量%，水懸粉劑為 0.1~20 重量%。

「實施例」

以下用實施例及試驗例詳細說明本發明。

[實施例 1]

N-(氯甲氧羰基)-N'-(4-甲基苯醯)-3-甲基-1,2-丁二胺(化合物編號 1)之合成法

在冰冷下加三乙胺 0.39g 於 N-(4-甲基苯醯)-3-甲基-1,2-丁二胺鹽酸鹽 0.50g 之二氯甲烷 6ml 溶液中後，再於冰冷下加氯甲酸氯甲酯 0.25g 之二氯甲烷 2ml 溶液，於室溫攪拌 4 小時。此反應液以矽膠管柱色析法精製(醋酸乙酯/己烷)，得白色結晶標題化合物 0.43g。

[實施例 2]

N-(2,2,2-三氟乙氧羰基)-N'-(4-甲基苯醯)-3-甲基-1,2-丁二胺(化合物編號 6)之合成法

在冰冷下，加 4-硝苯基氯甲酸酯 0.78g 之二氯甲烷 6ml 溶液於 2,2,2-三氟乙醇 0.42g 與三乙胺 0.43g 之混合液中。此反應液在冰冷下攪拌 1 小時後，在冰冷下加 N-(4-甲基苯醯)-3-甲基-1,2-丁二胺鹽酸鹽 0.50g。在冰冷下加三乙胺 0.21g 後，反

應液在冰冷下攪拌 1 小時，繼之在室溫攪拌 2 小時。反應液在室溫下放置 1 夜後減壓濃縮，加醋酸乙酯 50ml 於所得殘渣再用水清洗。有機液層以無水硫酸鎂乾燥後減壓濃縮得固體。此固體用二異丙基丙醚清洗後，以矽膠管柱色析法精製(醋酸乙酯/己烷)，得白色結晶標題化合物 0.34g。

[實施例 3]

N-(2,2,2-三氟乙氧羰基)-N'-(4-甲基苯醯)-3-甲基-1,2-丁二胺 (化合物編號 7)之合成法

在冰冷下加三乙胺 0.43g 於 N-(4-甲基苯醯)-3-甲基-1,2-丁二胺鹽酸鹽 0.50g 之二氯甲烷 5ml 溶液中後，在冰冷下加 2,2,2-三氟乙基氯甲酸酯 0.41g，在室溫攪拌 4 小時。反應液以矽膠管柱色析法精製(醋酸乙酯/己烷)，得白色結晶標題化合物 0.52g。

[實施例 4]

N-(1,1,1,3,3,3-六氟-2-丙氧羰基)-N'-(4-甲基苯醯)-3-甲基-1,2-丁二胺 (化合物編號 8)之合成法

在冰冷下加 1,1,1,3,3,3-六氟-2-丙醇 0.65g 與三乙胺 0.43g 之混合液於 4-硝苯基氯甲酸酯 0.78g 之二氯甲烷 6ml 溶液中。反應液在冰冷下攪拌 1 小時後，在冰冷下加 N-(4-甲基苯醯)-3-甲基-1,2-丁二胺鹽酸鹽 0.50g。此反應液在冰冷下攪拌 15 分鐘後，在冰冷下加三乙胺 0.21g。反應液在冰冷下攪拌 1 小時後，繼之在室溫攪拌 1 小時並在室溫放置 1 夜。加二氯甲烷 50ml 於此反應液後再用水清洗。有機液層以無水硫酸鎂乾燥後將減壓濃縮所得固體以矽膠管柱色析法精製(醋酸乙酯/己烷)，得白色結晶標題化合物 0.38g。

[實施例 5]

N-(2-二氯環己氧羰基)-N'-(4-甲基苯醯)-3-甲基-1,2-丁二胺(化合物編號 17)之合成法

在冰冷下加 4-硝苯基氯甲酸酯 5.00g 之二氯甲烷 25ml 溶液於 2-氯環己醇 3.33g 與吡啶 1.96g 之二氯甲烷 50ml 溶液中。反應液在室溫攪拌 3.5 小時後加二氯甲烷 100ml，再以飽和碳酸氫鈉水溶液清洗。有機液層以無水硫酸鎂乾燥後將減壓濃縮所得油狀物以矽膠管柱色析法精製(二氯甲烷/己烷)，得黃色油狀(2-二氯環己基)-(4-硝苯基)碳酸酯 4.43g。

在冰冷下加 N-(4-甲基苯醯)-3-甲基-1,2-丁二胺鹽酸鹽 2.00g 於(2-二氯環己基)-(4-硝苯基)碳酸酯 4.43g 之四氫呋喃 50ml 溶液中。在冰冷下加三乙胺 0.78g 後，將反應液在冰冷下攪拌 1 小時，繼之在室溫攪拌 2 小時。反應液在室溫放置 1 夜後減壓濃縮，加醋酸乙酯 200ml 於所得殘渣後再用水清洗。有機液層以無水硫酸鎂乾燥後將減壓濃縮所得油狀物以矽膠管柱色析法精製(醋酸乙酯/己烷→醋酸乙酯)，得白色結晶標題化合物 1.38g。

以下於表 1(表 1-1~表 1-2)中列示可與實施例 1~5 相同方法製造之以化學式(1)表示之化合物。並將其中數種化合物之物性值列示於表 2(表 2-1~表 2-9)。又表 1 中之 Me 為甲基、Et 為乙基、n-Pr 為正丙基、i-Pr 為異丙基、cyclohexyl 為環己基。且 i-Bu 為異丁基、t-Bu 為第三丁基、2-butyl 為 2-丁基、3-pentyl 為 3-戊基、cyclopentyl 為環戊基。

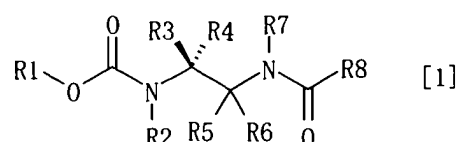


表 1 - 1 化學式(1)之化合物

化合物編號	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	R8
1	ClCH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
2	FCH ₂ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
3	ClCH ₂ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
4	BrCH ₂ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
5	ICH ₂ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
6	F ₃ CCH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
7	Cl ₃ CCH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
8	F ₃ C(F ₃ C)CH	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
9	FCH ₂ (FCH ₂)CH	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
10	ClCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
11	BrCH ₂ (CH ₂) CH	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
12	F ₃ C(Br CH ₂)CH	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
13	F ₃ CCF ₂ CF ₂ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
14	F ₃ CCF ₂ CF ₂ CF ₂ CH ₂ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
15	CH ₂ =C(Cl) CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
16	2-氟 -cyclohexyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
17	2-氯 -cyclohexyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
18	2-碘 -cyclohexyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
19	EtO(F ₃ C)CH	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
20	F ₃ CCH ₂	H	H	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄

表 2-1 化合物之物性數值(1)

化合物編號	物性數值
1	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (3H, d, J=7.3 Hz), 1.02 (3H, d, J=7.1 Hz), 1.85-1.94 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.45-3.51 (1H, m), 3.63-3.76 (2H, m), 5.24 (1H, d, J=8.5 Hz), 5.66 (1H, d, J=6.1 Hz), 5.72 (1H, d, J= 6.1 Hz), 6.59 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.66 (2H, d, J=8.1 Hz).
2	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (3H, d, J=7.3 Hz), 1.02 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.88-1.89 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.52-3.72 (2H, m), 3.69-3.72 (1H, m), 4.23-4.25 (1H, m), 4.30-4.45 (1H, m), 4.44-4.80 (1H, m), 4.56-4.60 (1H, m), 4.97 (1H, br-d, J=8.8 Hz), 6.78 (1H, br-s), 7.23 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.67 (2H, d, J=8.3Hz).
3	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.97 (3H, d, J=6.3 Hz), 0.99 (3H, d, J=6.3 Hz), 1.83-1.88 (1H, m), 2.38 (3H, s), 3.43-3.71 (5H, m), 4.19-4.24 (2H, m), 5.38 (1H, br-d, J=6.8 Hz), 7.06 (1H, br-s), 7.17 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.66 (2H, d, J=7.8 Hz).
4	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.02 (3H, d, J=6.9 Hz), 1.87-1.89 (1H, m), 2.40 (3H, s), 3.38-3.41 (2H, m), 3.51-3.71 (3H, m), 4.25-4.33 (2H, m), 4.98 (1H, br-d, J=7.8Hz), 6.75 (1H, br-s), 7.23 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.67 (2H, d, J=8.3 Hz).

表 2 - 2 化合物之物性數值(2)

5	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (3H, d, J=7.6 Hz), 1.02 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.87-2.05 (1H, m), 2.41 (3H, s), 3.13-3.17 (2H, m), 3.46-3.50 (1H, m), 3.59-3.70 (2H, m), 4.22-4.28 (2H, m), 4.93 (1H, br-d, J=8.8 Hz), 6.73 (1H, br-s), 7.23 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.67 (2H, d, J=8.3 Hz).
6	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.96-1.03 (6H, m), 1.85-1.91 (1H, m), 2.39(3H, s), 3.46-3.51 (1H, m), 3.61-3.72 (2H, m), 4.35-4.46 (2H, m), 5.26 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.62 (1H, br-s), 7.21-7.23 (2H, m), 7.63-7.65 (2H, m)
7	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.02 (3H, d, J=5.9 Hz), 1.03 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.86-1.94 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.48-3.53 (1H, m), 3.63-3.77 (2H, m), 4.64 (1H, d, J=12.0 Hz), 4.73 (1H, d, J=12.0 Hz), 5.25 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.64 (1H, br-s), 7.21 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.64 (2H, d, J=8.1Hz).
8	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.01 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.02 (3H, d, J=7.1 Hz), 1.86-1.94 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.46-3.52 (1H, m), 3.54-3.76 (2H, m), 5.56-5.67 (2H, m), 6.42 (1H, br-s), 7.22(2H, d, J=7.8 Hz), 7.70 (2H, J=8.1 Hz).

表 2 - 3 化合物之物性數值(3)

9	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.02 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.84-1.92 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.47-3.52 (1H, m), 3.59-3.74 (2H, m), 4.34-4.36 (1H, m), 4.51-4.52 (1H, m), 4.62-4.64 (1H, m), 5.00-5.12 (2H, m), 6.69 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.66 (2H, d, J=8.1 Hz).
10	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.01 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.82-1.92 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.43-3.57 (3H, m), 3.60-3.73 (2H, m), 4.10-4.20 (2H, m), 4.92 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.82 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.67 (2H, d, J=8.1 Hz).
11	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.01 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.02 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.85-1.90 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.34-3.74 (7H, m), 4.97-5.04 (2H, m), 6.62 (1H, br-s), 7.23 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.66 (2H, dd, J=8.3 Hz, 2.2 Hz).
12	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00-1.04 (6H, m), 1.87-1.93 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.31-3.34 (1H, m), 3.43-3.52 (2H, m), 3.58-3.75 (2H, m), 5.25-5.32 (1H, m), 5.41-5.47 (1H, m), 6.54-7.00 (1H, m), 7.21 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.62 (2H x 1/2, d, J=8.1 Hz), 7.66 (2H x 1/2, d, J=8.3 Hz).

表 2 - 4 化合物之物性數值(4)

13	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99 (3H, d, J=7.1Hz), 1.01 (3H, d, J=7.1Hz), 1.84-1.92 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.46-3.53 (1H, m), 3.61-3.73 (2H, m), 4.46-4.61 (2H, m), 5.21 (1H, br-d, J=7.6Hz), 6.55 (1H, br-s), 7.21 (2H, dd, J=8.1Hz, 0.5Hz), 7.63 (2H, d, J=8.1Hz).
14	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99 (3H, d, J=7.6Hz), 1.01 (3H, d, J=7.1Hz), 1.82-1.89 (1H, m), 2.21-2.40 (5H, m), 3.43-3.47(1H, m), 3.60-3.69 (2H, m), 4.26-4.31 (2H, m), 4.95 (1H, br-d, J=8.5Hz), 6.67 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=7.8Hz), 7.66 (2H, d, J=8.3Hz).
15	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (3H, d, J=7.1 Hz), 1.02 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.84-1.92 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.45-3.50 (1H, m), 3.60-3.75 (2H, m), 4.56 (1H, d, J=13.9 Hz), 4.62 (1H, d, J=13.9 Hz), 5.06 (1H, d, J=8.3 Hz), 5.26 (1H, s), 5.34 (1H, d, J=1.5 Hz), 6.73 (1H, br-d, J=3.2Hz), 7.22 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.65 (1H, d, J=8.3 Hz).
16	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99-1.02 (6H, m), 1.21-1.35 (3H, m), 1.71-1.90 (4H, m), 2.05-2.10 (2H, m), 2.38 (3H, s), 3.44-3.71 (3H, m), 4.26-4.40 (1H, m), 4.67-4.85(2H, m), 6.84 (1H, br-s), 7.21 (2H, d, J=7.1 Hz), 7.65-7.69 (2H, m).

表 2 - 5 化合物之物性數值(5)

17	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99-1.03 (6H, m), 1.24-1.39 (3H, m), 1.59-1.71 (3H, m), 1.84-1.88 (1H, m), 2.05-2.17 (2H, m), 2.38 (3H, d, J=1.5 Hz), 3.49-3.74 (4H, m), 4.62-4.74 (1H, m), 4.88 (1H, d, J=5.6Hz), 6.80 (1H, br-s), 7.20-7.22 (2H, m), 7.67 (2H, d, J=7.1 Hz).
18	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99-1.05 (6H, m), 1.19-2.38 (12H, m), 3.46-3.78 (3H, m), 3.89-4.04 (1H, m), 4.71-4.87 (2H, m), 6.79 (1H, br-s), 7.21 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.66-7.70 (2H, m).
19	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.96-1.03 (6H, m), 1.26 (3H, t, J= 7.1Hz), 1.8-1.9 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.47-3.72 (5H, m), 5.26-5.35 (1H, m), 5.89-5.91 (1H, m), 6.5-6.6 (1H, m), 7.20-7.22 (2H, m), 7.60-7.67 (2H, m).
20	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 2.40 (3H, s), 3.46-3.50 (2H, m), 3.60-3.64 (2H, m), 4.43 (2H, q, J = 8.5 Hz), 5.57 (1H, br-s), 6.66 (1H, br-s), 7.23-7.26 (2H, m), 7.66-7.68 (2H, m).
21	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.01 (3H, t, J=7.6 Hz), 1.50-1.71 (2H, m), 2.39 (3H, s), 3.49-3.62 (2H, m), 3.72-3.81 (1H, m), 4.34-4.50 (2H, m), 5.29 (1H, d, J=8.1 Hz), 6.66 (1H, br-s) 7.22-7.24 (2H, m), 7.65 (2H, d, J=8.3 Hz).

表 2-6 化合物之物性數值(6)

22	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.95 (3H, t, J=7.2 Hz), 1.37-1.58 (4H, m), 2.40 (3H, s), 3.48-3.61 (2H, m), 3.82-3.87 (1H, m), 4.36-4.47 (2H, m), 5.25 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.68 (1H, br-s), 7.23 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.65 (2H, d, J=8.3 Hz).
23	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.95 (3H, d, J=6.3 Hz), 0.96 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.36-1.47 (2H, m), 1.69-1.74 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.48-3.55 (2H, m), 3.90-3.95 (1H, m), 4.36-4.46 (2H, m), 5.11 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.65 (1H, br-s), 7.23 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.65 (2H, d, J=8.1 Hz).
24	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.04 (9H, s), 2.38 (3H, s), 3.50-3.53 (1H, m), 3.65-3.69 (2H, m), 4.31-4.42 (2H, m), 5.21 (1H, br-d, J=8.8 Hz), 6.55 (1H, br-s), 7.19 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.60-7.62 (2H, m).
25	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.95 (3H, t, J=7.3 Hz), 0.99 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.20-1.25 (1H, m), 1.53-1.67 (2H, m), 2.39 (3H, s), 3.46-3.51 (1H, m), 3.61-3.69 (1H, m), 3.73-3.78 (1H, m), 4.35-4.45 (2H, m), 5.25 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.60 (1H, br-s), 7.21-7.24 (2H, m), 7.64 (2H, d, J=8.3 Hz).

表 2 - 7 化合物之物性數值(7)

28	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.01 (3H, d, J=7.1 Hz), 1.03 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.88-1.93 (1H, m), 3.54-3.74 (3H, m), 4.36-4.48 (2H, m), 5.24 (1H, d, J=8.8 Hz), 6.95 (1H, br-s), 7.26-7.31 (1H, m), 7.39-7.50 (3H, m), 7.66 (1H, d, J=8.1 Hz)
30	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98 (3H, d, J=6.8Hz), 1.00 (3H, d, J=6.8Hz), 1.18 (1/2H, d, J=6.8Hz), 1.36 (1/2H, d, J=6.8Hz), 1.84-1.86 (1H, m), 3.42-3.66 (2H, m) 3.67-3.70 (1H, m), 5.03-5.10 (1H, m), 5.22 (1H, br-s), 5.12-5.19 (1H, m), 6.58 (1H, br-s), 7.18-7.22 (2H, m), 7.60-7.65 (2H, m).

表 2 - 8 化合物之物性數值(8)

31	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.97 (9H, s), 3.54-3.58 (1H, s), 3.61-3.70 (2H, m), 4.31-4.41 (2H, m), 5.18 (1H, br-s), 6.91 (1H, br-s), 7.23-7.27 (1H, m), 7.35-7.45 (1H, d, J=7.8Hz).
32	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.92-1.00 (6H, m), 1.55-1.58 (1H, m), 3.54-3.54 (1H, m), 3.76-3.79 (1H, m), 4.37-4.42 (2H, m), 5.21 (1H, br-d, J=8.9Hz), 6.92 (1H, br-s), 7.26-7.38 (1H, m), 7.40-7.49 (3H, m), 7.65 (1H, d, J=7.6Hz).
33	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98-1.00 (3H, m), 0.92-0.96 (3H, m), 1.22-1.26 (2H, m), 1.60-1.70 (2H, m), 3.60-3.65 (2H, m), 3.66-3.70 (1H, m), 4.35-4.42 (1H, m), 7.46-7.56 (2H, m), 7.60-7.63 (1H, m), 7.96 (1H, d, J=7.6Hz), 8.06 (1H, d, J=8.4Hz).
34	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.02 (6H, t, J=6.8Hz), 1.87-1.95 (1H, m), 3.53-3.76 (3H, m), 4.36-4.52 (2H, m), 5.20 (1H, d, J=8.8Hz), 6.78 (1H, br-s), 7.37-7.45 (2H, m), 7.73 (1H, s), 7.82-7.86 (2H, m).
35	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.01 (9H, s), 2.39 (3H, s), 3.50-3.54 (1H, m), 3.61-3.69 (2H, m), 4.34-4.42 (2H, m), 5.12 (1H, d, J=8.8Hz), 6.48 (1H, br), 7.22 (2H, d, J=8.3Hz), 7.62 (2H, d, J=8.3Hz).
36	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.27-1.36 (2H, m), 1.53-1.71 (4H, m), 1.79-1.86 (2H, m), 1.95-2.01 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.52-3.63 (2H, m), 3.68-3.74 (1H, m), 4.35-4.46 (2H, m), 5.22 (1H, d, J=8.3Hz), 6.68 (1H, br), 7.22 (2H, d, J=8.3Hz), 7.64 (2H, d, J=8.3Hz).

表 2-9 化合物之物性數值(9)

37	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.01 (3H, d, J=6.8Hz), 1.04 (3H, d, J=6.8Hz), 1.86-1.95 (1H, m), 3.61-3.79 (3H, m), 4.34-4.49 (2H, m), 5.15 (1H, d, J=8.8Hz), 7.23-7.32 (1H, m), 7.63-7.65 (2H, m), 8.00-8.04 (1H, m).
38	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.01 (3H, d, J=6.8Hz), 1.04 (3H, d, J=6.8Hz), 1.84-1.94 (1H, m), 3.59-3.79 (3H, m), 4.34-4.49 (2H, m), 5.24 (1H, d, J=9.3Hz), 7.48-7.58 (2H, m), 7.74 (1H, br-s), 7.97 (1H, d, J=7.3Hz), 8.07 (1H, d, J=7.8Hz).
39	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.88-0.99 (6H, m), 1.29-1.51 (5H, m), 3.49-3.56 (1H, m), 3.64-3.72 (1H, m), 3.95-4.01 (1H, m), 4.36-4.46 (2H, m), 5.15 (1H, d, J=9.3), 6.99 (1H, br), 7.27-7.31 (1H, m), 7.39-7.51 (3H, m), 7.67 (1H, d, J=7.8Hz).
40	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.26 (3H, d, J= 6.8Hz), 3.52-3.62 (1H, m), 3.93-3.99 (1H, m), 4.35-4.49 (2H, m), 5.44 (1H, d, J=6.8Hz), 7.01 (1H, br-s), 7.26-7.30 (1H, m), 7.39-7.43 (1H, m), 7.46-7.50 (1H, m), 7.66 (1H, d, J=7.8Hz).

「製劑例及試驗例」

其次舉示有關本發明之植物病害防治劑製劑例及植物病害防治活性試驗例。於下述說明中之『份』為『重量份』。

[實施例 6] 粒劑

均勻混鍊本發明之化合物(化合物編號 1)30 份、膨潤土 22 份、滑石 45 份、索泡(Sorpol 5060、界面活性劑、日本東邦化學股份有限公司商品名稱)3 份、及少量消泡劑後，用籃式造粒機造粒並乾燥得粒劑 100 份。

[實施例 7] 粒劑

混合本發明之化合物(化合物編號 2)15 份、膨潤土 60 份、滑石 21 份、十二烷基苯磺酸鈉 1 份、聚氧乙烯烷芳基醚 1 份、及木質磺酸鈉 2 份，加適量之水均勻混鍊後，用籃式造粒機造粒並乾燥得粒劑 100 份。

[實施例 8] 可濕性粉劑

將本發明之化合物(化合物編號 3)50 份、碳酸鈣 40 份、索泡(Sorpol 5039、陰離子界面活性劑與白炭黑之混合物、日本東邦化學股份有限公司商品名稱)5 份、及白炭黑 5 份均勻混合粉碎成可濕性粉劑。

[實施例 9] 可濕性粉劑

將本發明之化合物(化合物編號 4)30 份、高嶺土 63 份、索泡(Sorpol 5039、陰離子界面活性劑與白炭黑之混合物、日本東邦化學股份有限公司商品名稱)5 份、及白炭黑 2 份均勻混合粉碎成可濕性粉劑。

[實施例 10] 乳劑

將本發明之化合物(化合物編號 5)20 份、二甲苯 55 份、N,N-二甲基甲醯胺 20 份、索泡(Sorpol 2680、界面活性劑)5 份均勻混合成乳劑。

[實施例 11] 水懸粉劑

先均勻溶解索泡(Sorpol 3353、非離子性界面活性劑、日本東邦化學股份有限公司商品名稱)5 份、咕噸膠之 1%水溶液 5 份、水 40 份、乙二醇 10 份後，加本發明之化合物(化合物編號 6)40 份並充分攪拌後用混砂機進行濕式粉碎，得水懸粉劑。

[實施例 12] 粉劑

均勻混合本發明之化合物(化合物編號 7)5 份、粘土 95 份得粉劑。

[實施例 13] 水稻稻熱病防治效果試驗(撒布試驗)

表 4 水稻稻熱病防治效果試驗(撒布試驗)

化合物編號	效果	化合物編號	效果
2	A	25	A
3	A	28	A
4	A	30	A
5	A	31	A
6	A	32	A
7	A	33	A
8	A	34	A
9	A	35	A
10	A	36	A
11	B	37	A
13	A	38	A
14	B	39	A
15	A	40	A
16	A	化學式(7)	C
17	A	化學式(8)	C
24	A		

[實施例 14] 水稻稻熱病防治效果試驗(水面施用)

將水稻(品種：越光、3 葉期)移植於 1 / 5000 瓦格納植鉢 (Wagner pot)，在溫室培育 1 週後，將依製劑例 7 所調製之粒劑以 1.5kg / 10 are 用量施用於水面。藥劑處理後 30 日以稻熱病孢子懸浮液進行噴霧接種，於溫度 25℃ 及高濕度條件下放置 1 週後調查病斑數。由下式計算防治值並以表 5 所示標準表示。結果如表 6 所示。又對照藥劑使用與實施例 13 相同之對照藥劑。

表 5

$$\text{防治值(\%)} = (1 - \text{處理區發病數} / \text{對照區發病數}) \times 100$$

效果	防治值
A	80%以上
B	50%以上 80%以下
C	50%以下

表 6 水稻稻熱病防治效果試驗(水面施用)

化合物編號	效果	化合物編號	效果
1	A	28	A
2	A	30	A
6	A	31	A
15	A	化學式(7)	C
24	A	化學式(8)	C
25	A		

「產業上利用之可能性」

有關本發明之二胺化合物，由於對水稻稻熱病表現優異防治效果，故有用於當作植物病害防治劑。

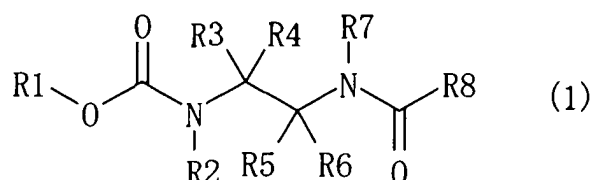
【圖式簡單說明】 無

【主要元件符號說明】 無

五、中文發明摘要：

本發明旨在提供二胺衍生物與其製造方法及以該化合物為有效成分之植物病害防治劑。

依據本發明，可提供以化學式(1)表示之二胺衍生物與其製造方法及含有該化合物當作有效成分之植物病害防治劑。

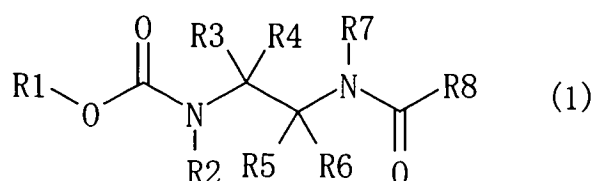


[式中，R1 為被鹵素所取代之 1~6 個碳原子烴基等，R2 及 R7 各別為獨立之氫原子、1~6 個碳原子烴基等，R3 及 R4 各別為獨立之氫原子或可被取代之 1~6 個碳原子烴基、或為含鍵結碳原子之 3~6 個碳原子環烷基，R5 及 R6 各別為獨立之氫原子、1~6 個碳原子烴基等，R8 為可被取代之芳烷基、可被取代之芳基或可被取代之雜芳基。]

六、英文發明摘要：

It is an object of the present invention to provide an objective diamine derivative, a method for manufacturing the same, and a plant disease control agent containing the above-described compound as an active component.

According to the present invention, a diamine derivative represented by Formula (1), a method for manufacturing the same, and a plant disease control agent containing the above-described compound as an active component are provided.

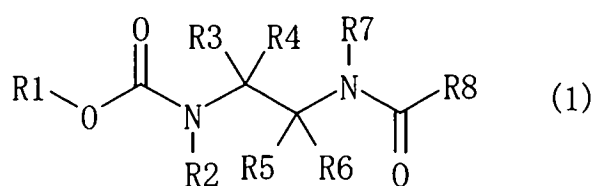


[In Formula, R1 represents, for example, a halogenated hydrocarbon having the carbon number of 1 to 6; R2 and R7 independently represent, for example, a hydrogen atom or a hydrocarbon having the carbon number of 1 to 6; R3 and R4 independently represent, for example, a hydrogen atom or a hydrocarbon which has the carbon number of 1 to 6 and which may have a substituent, or represent a cycloalkyl group having the carbon number of 3 to 6 including a carbon atom bonding to R3 and R4; R5 and R6 independently represent, for example, a hydrogen atom or a hydrocarbon group having the carbon number of 1 to 6; and R8 represents an arylalkyl group which may have a substituent, an aryl group which may have a substituent, or a heteroaryl group which may have a substituent.]

七、指定代表圖：無

(一)本案指定代表圖為：第()圖。

(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：

公告本

發明專利說明書

2007年1月5日修訂

修正頁

(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：P3132170

※申請日期：P3.10.27

※IPC 分類：A01N 27/12, C07C 271/00
(200601)

一、發明名稱：(中文/英文)

二胺衍生物與其製造方法及以該二胺衍生物為有效成分的植物病害防治劑

DIAMINE DERIVATIVE, METHOD FOR MANUFACTURING
THE SAME AND PLANT DISEASE CONTROL AGENT
CONTAINING THE SAME AS ACTIVE COMPOUND

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

三井化學股份有限公司 / MITSUI CHEMICALS, INC.

代表人：(中文/英文) 中西 宏幸 / NAKANISHI, HIROYUKI

住居所或營業所地址：(中文/英文)

〒105-7117 日本國東京都港區東新橋一丁目 5 番 2 號

5-2, Higashi-Shimbashi 1-chome, Minato-ku, Tokyo, 105-7117 Japan

國 籍：(中文/英文) 日本 / JAPAN

三、發明人：(共 6 人)

1. 姓 名：(中文/英文) 海老原 耕一 / EBIHARA, KOICHI

國 籍：(中文/英文) 日本 / JAPAN

2. 姓 名：(中文/英文) 森實 邦彦 / MORIZANE, KUNIHICO

國 籍：(中文/英文) 日本 / JAPAN

3. 姓 名：(中文/英文) 戶村 直文 / TOMURA, NAOFUMI

國 籍：(中文/英文) 日本 / JAPAN

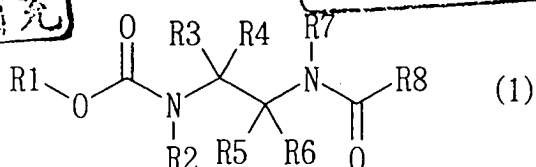
4. 姓 名：(中文/英文) 江崎 龍太郎 / EZAKI, RYUTARO

國 籍：(中文/英文) 日本 / JAPAN

100年2月21日修正
補充

公告本

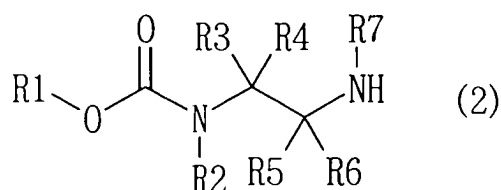
100年2月21日修正替換頁
093132510(無劃線版)



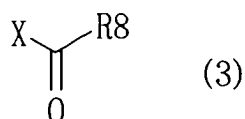
[式中，R1 為被鹵素所取代之 1~6 個碳原子烴基；R2 及 R7 各別為獨立之氫原子、1~6 個碳原子烴基或醯基；R3 及 R4 各別為獨立之氫原子、可被取代之 1~6 個碳原子烴基或可被取代之雜芳基，或為含鍵結碳原子之 3~6 個碳原子環烷基；R5 及 R6 各別為獨立之氫原子、1~6 個碳原子烴基；R8 為可被取代之芳烷基、可被取代之芳基或可被取代之雜芳基]。

[2] 一種植物病害防治劑，其特徵為含有上述[1]項所記載二胺衍生物為有效成分。

[3] 一種上述[1]項所記載二胺衍生物之製造方法，其特徵為以化學式(2)表示之化合物與以化學式(3)表示之化合物進行反應：

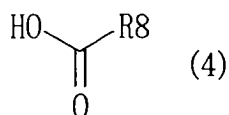


[式中，R1、R2、R3、R4、R5、R6 及 R7 與上述[1]項所定義相同]，



[式中，R8 與上述[1]項所定義相同，X 為離去基]。

[4] 一種上述[1]項所記載二胺衍生物之製造方法，其特徵為以化學式(2)表示之化合物與以化學式(4)表示之化合物進行反應：



[式中，R8 與上述[1]項所定義相同]。

[5] 一種上述[1]項所記載二胺衍生物之製造方法，其特徵為以化學式(5)表示之化合物與以化學式(6)表示之化合物進行反應：


$$\text{R1}-\text{O}-\overset{\overset{\text{O}}{\parallel}}{\text{C}}-\text{X} \quad (6)$$

8

(5022)

公 告 本

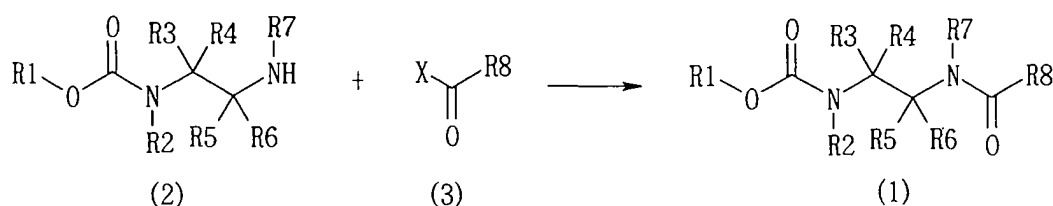
100 年 2 月 21 日修正替換頁
093132510(無劃線版)

磺醯胺基、丙磺醯胺基、丁磺醯胺基等烷磺醯胺基，三氟甲磺醯胺基、二氟甲磺醯胺基、三氟乙磺醯胺基等鹵素取代烷磺醯胺基，氟、氯、溴、碘等鹵素原子，乙醯基、苯醯基等醯基。

在以化學式(3)及以化學式(6)表示之化合物中，關於以 X 代表之離去基可舉例如以氯為代表之鹵素原子，以甲氧基、乙氧基為代表之烷氧基，以苯氧基、4-硝苯基為代表之芳氧基，以乙醯氧基、苯甲醯氧基為代表之醯氧基，以甲氧羰氧基為代表之烷氧羰氧基，以苯氧羰基為代表之芳氧羰基，以甲硫基為代表之烷硫基，2,5-二氧吡咯烷氧基、苯並三唑烷氧基及咪唑基等。

以化學式(1)表示之本發明之化合物為新穎化合物，該化學式(1)表示之化合物可依反應式(1)所記述方法製造之。

反應式(1)



[式中，R1、R2、R3、R4、R5、R6 及 R7 與上述以化學式(2)表示之化合物所定義相同，R8 及 X 則與以上述化學式(3)表示之化合物所定義相同]。

於反應式(1)，將以化學式(2)表示之二胺衍生物或其鹽與以化學式(3)表示之習知羰基化合物在無溶劑或溶劑中、無鹼類或鹼類存在下進行反應，製造以化學式(1)表示之二胺衍生物。

在以反應式(1)表示之反應中所使用之鹼類，可舉例如氫氧化鈉、氫氧化鉀等氫氧化鹼金屬類，氫氧化鎂、氫氧化鈣等氫氧化鹼土金屬類，氫化鈉、氫化鉀等氫化鹼金屬類，甲醇鈉、乙醇鈉等鹼金屬醇鹽類，氧化鈉等鹼金屬氧化物類，碳酸鉀、碳酸鈉等碳酸鹽類，磷酸三鉀、磷酸三鈉、磷酸氫二鉀、磷酸氫二鈉等磷酸鹽類，醋酸鈉、醋酸鉀等醋酸鹽類，吡啶、4-(二甲胺基)吡啶、三乙胺、重氮二環十一烷等有機鹼類。

此等鹼類之使用量並無特別限制，如使用上述有機鹼類時亦

公告本

99.9.16 修正
補充99年9月16日修正替換頁
093132510(無劃線版)

表 1-2 化學式(I)之化合物

化合物編號	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	R8
21	F3CCH2	H	Et	H	H	H	H	4-MeC6H4
22	F3CCH2	H	n-Pr	H	H	H	H	4-MeC6H4
23	F3CCH2	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC6H4
24	F3CCH2	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC6H4
25	F3CCH2	H	2-butyl	H	H	H	H	4-MeC6H4
28	F3CCH2	H	i-Pr	H	H	H	H	2-苯並呋喃基
30	F3CCH2	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC6H4
31	F3C(CH3)C H	H	t-Bu	H	H	H	H	2-苯並呋喃基
32	F3CCH2	H	2-butyl	H	H	H	H	2-苯並呋喃基
33	F3CCH2	H	2-butyl	H	H	H	H	2-苯並呋喃基
34	F3CCH2	H	i-Pr	H	H	H	H	2-苯並噻吩基
35	F3CCH2	H	t-Bu, H		H	H	H	4-MeC6H4
36	F3CCH2	H	cyclo-pentyl	H	H	H	H	4-MeC6H4
37	F3CCH2	H	i-Pr	H	H	H	H	6-氟-2-苯並噻 唑基
38	F3CCH2	H	i-Pr	H	H	H	H	2-苯並噻唑基
39	F3CCH2	H	3-pentyl	H	H	H	H	4-MeC6H4
40	F3CCH2	H	Me, H		H	H	H	2-苯並呋喃基

公 告 本

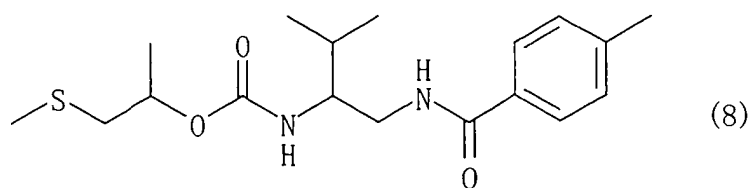
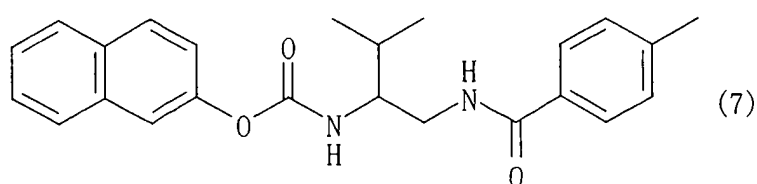
將依實施例 9 調製之可濕性粉劑之 200ppm 稀釋液撒布於植鉢栽培水稻(品種：越光、2 葉期)後風乾。將植盆移入人工氣象室(設定條件：22℃、日夜各 12 小時)，以稻熱病孢子懸浮液進行噴霧接種。人工氣象室保持高濕度，經 7 日後調查發病情形。由下式計算防治值並以表 3 所示標準表示。結果如表 4-1、表 4-2 所示。

表 3

$$\text{防治值(\%)} = (1 - \text{處理區發病數} / \text{對照區發病數}) \times 100$$

效果	防治值
A	80%以上
B	50%以上 80%以下
C	50%以下

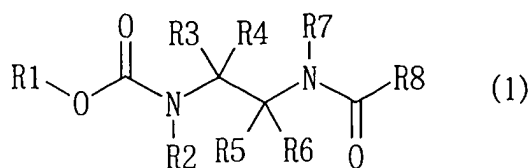
又，對照藥劑使用 W02003008372 記載之下列化學式(7)與化學式(8)。



(02) >

十一、申請專利範圍：

1. 一種二胺衍生物，其特徵為以化學式(1)表示：



[式中，R1 為被鹵素所取代之 1~6 個碳原子烷基、被鹵素所取代之 3~6 個碳原子環烷基、被鹵素所取代之 2~6 個碳原子烯基或被鹵素所取代之 3~6 個碳原子環烯基；

R2 與 R7 各別為獨立之氫原子、1~6 個碳原子烷基、3~6 個碳原子環烷基、2~6 個碳原子烯基、3~6 個碳原子環烯基、2~6 個碳原子炔基、或醯基；

R3 與 R4 各別為獨立之氫原子、可被取代之 1~6 個碳原子烷基、可被取代之 3~6 個碳原子環烷基、2~6 個碳原子烯基、3~6 個碳原子環烯基、2~6 個碳原子炔基，或為含鍵結碳原子之 3~6 個碳原子環烷基；

R5 與 R6 各別為獨立之氫原子、1~6 個碳原子烷基、3~6 個碳原子環烷基、2~6 個碳原子烯基、3~6 個碳原子環烯基、2~6 個碳原子炔基；

R8 為可被 1~6 個碳原子烷基取代之苯基、可被鹵素原子取代之苯基、可被 1~6 個碳原子烷基取代之雜芳基、可被鹵素原子取代之雜芳基；惟，該雜芳基為苯並呋喃基、苯並噻唑基、苯並噻吩基。

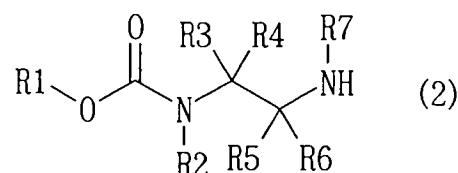
2. 如申請專利範圍第 1 項之二胺衍生物，其中，R2 與 R7 各別為獨立之氫原子、1~6 個碳原子烷基、3~6 個碳原子環烷基、或醯基；R3 與 R4 各別為獨立之氫原子、可被取代之 1~6 個碳原子烷基、可被取代之 3~6 個碳原子環烷基、2~6 個碳原子烯基，或為含鍵結碳原子之 3~6 個碳原子環烷基；R5 與 R6 各別為獨立之氫原子、1~6 個碳原子烷基、3~6 個碳原子環烷基。

3. 如申請專利範圍第 2 項之二胺衍生物，其中，R2 與 R7 各別為獨立之氫原子、1~6 個碳原子烷基或醯基；R3 與 R4 各別為獨立之氫原子、可被取代之 1~6 個碳原子烷基、可被取代之 3~6 個碳原子環烷基，或為含鍵結碳原子之 3~6 個碳原子環烷基；R5 與 R6 各別為獨立之氫原子或 1~6 個碳原子烷基。

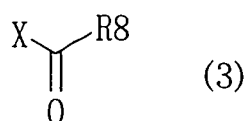
4. 如申請專利範圍第 3 項之二胺衍生物，其中，R2、R5、R6 及 R7 為氫原子。

5. 一種水稻病害防治劑，其特徵為含有如上述申請專利範圍第 1~4 項任一項所記載之二胺衍生物為有效成分。

6. 一種製造如上述申請專利範圍第 1 項所記載之二胺衍生物之方法，其特徵為以化學式(2)表示之化合物與以化學式(3)表示之化合物進行反應：

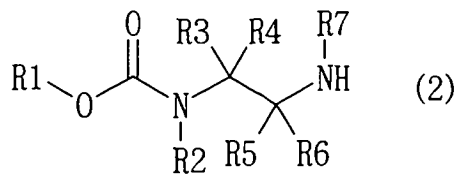


[式中，R1、R2、R3、R4、R5、R6 及 R7 與如上述申請專利範圍第 1 項所定義相同]，

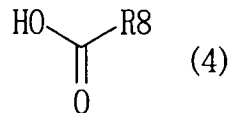


[式中，R8 與如上述申請專利範圍第 1 項所定義相同，X 為離去基]。

7. 一種製造如上述申請專利範圍第 1 項所記載之二胺衍生物之方法，其特徵為以化學式(2)表示之化合物與以化學式(4)表示之化合物進行反應：

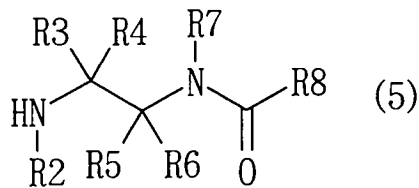


[式中，R1、R2、R3、R4、R5、R6 及 R7 與如上述申請專利範圍第 1 項所定義相同]，

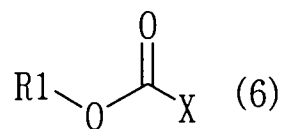


[式中，R8 與如上述申請專利範圍第 1 項所定義相同]。

8. 一種製造如上述申請專利範圍第 1 項所記載之二胺衍生物之方法，其特徵為以化學式(5)表示之化合物與以化學式(6)表示之化合物進行反應：



[式中，R2、R3、R4、R5、R6、R7 及 R8 與如上述申請專利範圍第 1 項所定義相同]，



[式中，R1 與如上述申請專利範圍第 1 項所定義相同，X 為離去基]。