

發明專利說明書

(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： 97120838

※ 申請日期： 97.6.5

※IPC 分類：

A01N 43/56 (2006.01)

A01N 43/08 (2006.01)

A01N 37/46 (2006.01)

A01P 3/00 (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

具殺真菌活性之化合物組合物

FUNGICIDAL ACTIVE COMPOUND COMBINATION

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

拜耳作物科學股份有限公司

BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT

代表人：(中文/英文)

1.包亞歷/BADER, AXEL

2.傑羅夫/JESSE, RALF-RUEDIGER

住居所或營業所地址：(中文/英文)

德國莫罕城艾諾貝耳街 50 號

Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Germany

國 籍：(中文/英文)

德國/GERMANY

三、發明人：(共 2 人)

姓 名：(中文/英文)

1.蘇函茲/SUTY-HEINZE, ANNE

2.戴彼得/DAHMEN, PETER

國 籍：(中文/英文)

1.為法國/FRANCE

2.為德國/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：

歐洲專利公約；西元 2007 年 06 月 06 日；07011094.5

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】

本發明係關於含有已知殺真菌活性化合物 *N*-[2-(1,3-二甲丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醯胺、滅達樂(metalaxyl)和三唑的新穎活性化合物組合物，其極適合用於控制有害的植物病原性真菌。此外，本發明係關於一種治癒或預防性處理植物或有用植物之植物病原性真菌的方法，其特別指非僅處理種籽本身之例如穀物種籽的種籽處理。

【先前技術】

已習知 *N*-[2-(1,3-二甲丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醯胺、滅達樂和三唑(3)各具有殺真菌活性[請參考殺蟲劑手冊，第 13 版(2003)，第 468f、304f 和 923~925 頁]。這些化合物具有極佳的活性；然而，在某些情況時仍不足夠。

由於現代殺真菌劑逐漸重視其在生態學和經濟學上的需求，例如針對活性範圍、毒性、選擇性、施用量、形成殘留物和有利於製造以及例如進一步可能造成困擾的抗藥性，因此需發展至少可克服一部分上述缺點的新穎殺真菌劑。

【發明內容】

本發明提供可至少達到一部分目標的活性化合物組合

物或組成物。

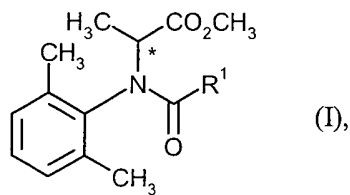
目前已驚奇地發現本發明的活性化合物組合物或組成物不僅具有個別活性成分的加成效應亦具有協同效果。因此，首先可減少個別成分的用量。其次，本發明之活性化合物組合物可利用不具個別化合物(足夠)活性之低劑量提供殺植物病原菌的高效活性。基本上，此可首先擴大活性範圍及其次增加使用上的安全性。

除了殺真菌的協同活性之外，根據本發明的活性化合物組合物進一步具有在廣義上被稱為協同的驚人性質，舉例如：擴大對例如植物疾病之抗性病原菌的活性範圍；減少活性化合物的使用量；藉由根據本發明活性化合物組合物之助即使在個別化合物無活性的用量之下仍足以控制害蟲；在研磨、篩檢、乳化、溶解或施藥的配製或使用期間具較有利的性質例如改善儲存和光照安定性；減少形成殘留物；毒性或生態學上的改善；改善植物例如生長、收穫量、根部發育、較大葉面區域、較綠樹葉、較易發芽、較低種籽需要量、較低植物毒性的性質；穩定化植物防禦系統或與植物具有較佳的相容性。因此，使用本發明的活性化合物組合物或組成物可保持植物嫩莖的健康而提高例如經種籽處理之穀物的冬季存活率及品質和產量。此外，本發明活性化合物組合物可強化系統性作用。即使組合物的個別化合物不具有足夠的系統性作用，根據本發明的活性化合物組合物仍具有此性質。在一類似的模式中，根據本發明的活性化合物組合物可導致較持續性的殺真

菌作用。

目前已發現該活性化合物組合物具有極佳的殺真菌性質，其含有：

- (1) *N*-[2-(1,3-二甲丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醯胺或其鹽類；以及
- (2) 至少一種通式(I)的醯基丙胺酸

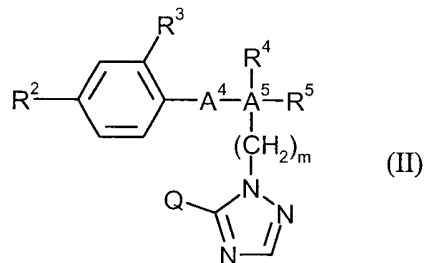


其中

* 為 R-或 S-構型中較佳為 S-構型的碳原子；

R¹ 代表苄基、呋喃基或甲氧甲基，或其鹽；以及

- (3) 至少一種通式(II)的三唑



其中

Q 代表氫或 SH；

m 代表 0 或 1；

R² 代表氫、氟、氯、苯基或 4-氯苯氧基；

R³ 代表氫或氯；

A⁴ 代表直接鍵、-CH₂-、-(CH₂)₂-或-O-；

A⁴ 進一步代表 *-CH₂-CHR¹⁷- 或 *-CH=CR¹⁷-，其中*
鍵係連接至苯環，其 R¹⁵ 和 R¹⁷ 共同代表 -CH₂-
CH₂-CH-[CH(CH₃)₂]- 或 -CH₂-CH₂-C(CH₃)₂-；

A⁵ 代表 C 或 Si(矽)；

5 R⁴ 代表氫、羥基或氰基；

R⁵ 代表 1-環丙乙基、1-氯環丙基、C₁~C₄-烷基、
C₁~C₆-羥烷基、C₁~C₄-烷羰基、C₁~C₂-鹵烷氧基
-C₁~C₂-烷基、三甲基矽烷基-C₁~C₂-烷基、單氟苯
基或苯基；

10 R⁴ 和 R⁵ 進一步共同代表 -O-CH₂-CH(R⁶)-O-、
-O-CH₂-CH(R⁶)-CH₂- 或 -O-CH-(2-氯苯基)-；

R⁶ 代表氫、C₁~C₄-烷基或溴，或其鹽類。

15 活化化合物組合物內的活化化合物若在某些重量比
範圍內時具有特別明顯的協同效果。然而，活化化合物組
合物內活化化合物的重量比具有極大範圍的變化。

一般而言，每重量比率的三唑(3)中含有：

0.005~500 的醯基丙胺酸(2)重量比率，較佳為 0.01~100，
更佳為 0.05~50，最佳為 0.1~10；以及

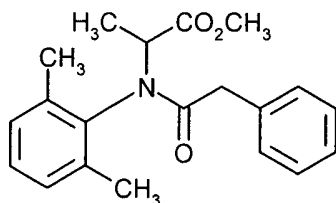
20 0.005~500 的 *N*-[2-(1,3-二甲丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基
-1*H*-吡唑-4-甲醯胺重量比率，較佳為 0.01~100，更佳為
0.05~50，最佳為 0.1~10。

活化化合物三唑(3)、醯基丙胺酸(2)和 *N*-[2-(1,3-二甲
丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醯胺視需要可存

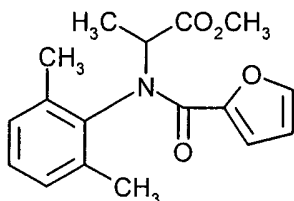
在其鹽類型式。

式(I)的醯基丙胺酸(2)較佳為選自由下列構成的群組：

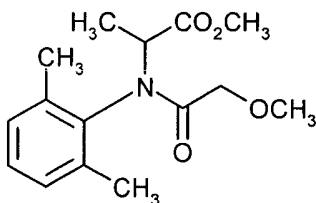
(2-1) 下式的本達樂(benalaxyl)(取自 DE-A 29 03 612)



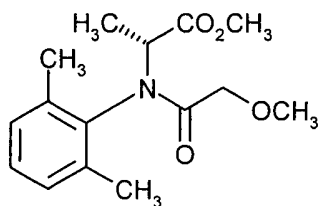
5 (2-2) 下式的呋霜靈(furalaxyl)(取自 DE-A 25 13 732)



(2-3) 下式的滅達樂(metalaxyl)(取自 DE-A 25 15 091)



(2-4) 下式的滅達樂-M(取自 WO 96/01559)

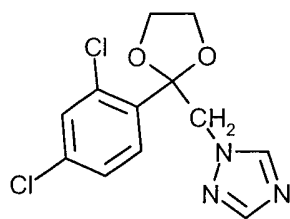


10

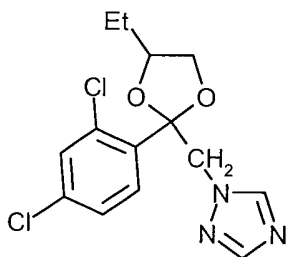
其中以滅達樂、滅達樂-M為最佳。

式(II)的三唑(3)較佳為選自由下列構成的群組：

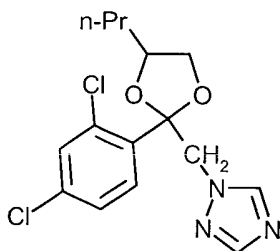
(3-1) 下式戊環唑(azaconazole)(取自 DE-A 25 51 560)



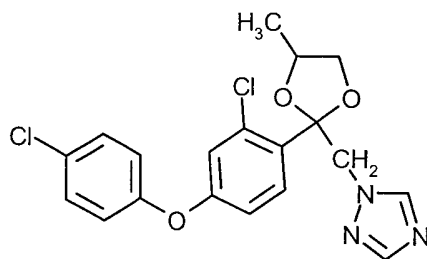
(3-2) 下式乙環唑(etaconazole)(取自 DE-A 25 51 560)



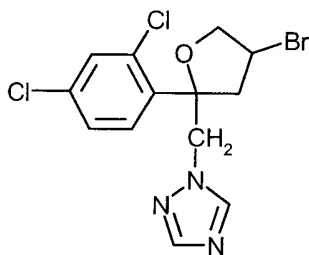
5 (3-3) 下式丙環唑(propiconazole)(取自 DE-A 25 51 560)



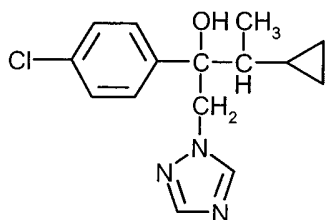
(3-4) 下式噁醚唑(difenoconazole)(取自 EP-A 0 112 284)



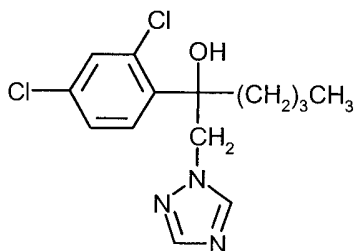
(3-5) 下式糠菌唑(bromuconazole)(取自 EP-A 0 258 161)



(3-6) 下式環丙唑醇(cyproconazole)(取自 DE-A 0 258 161)

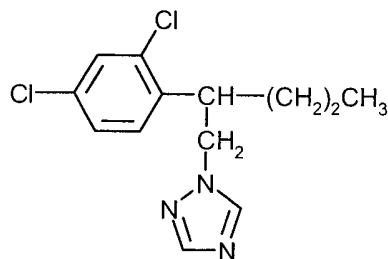


(3-7) 下式己唑醇(hexaconazole)(取自 DE-A 30 42 303)

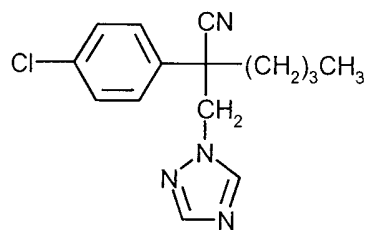


5

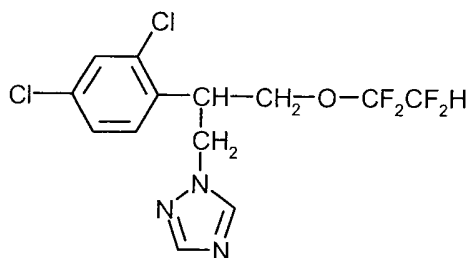
(3-8) 下式戊菌唑(penconazole)(取自 DE-A 27 35 872)



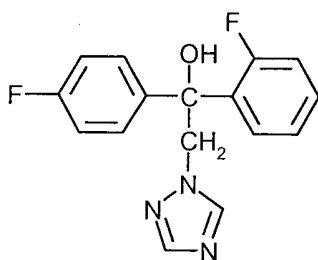
(3-9) 下式腈菌唑(myclobutanil)(取自 EP-A 0 145 294)



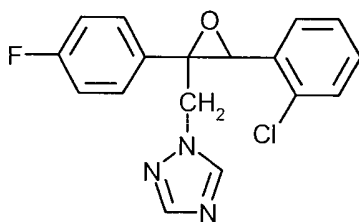
(3-10) 下式四氟醚唑(tetraconazole)(取自 EP-A 0 234 242)



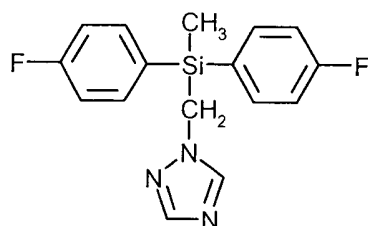
(3-11) 下式粉唑醇(flutriafol)(取自 EP-A 0 015 756)



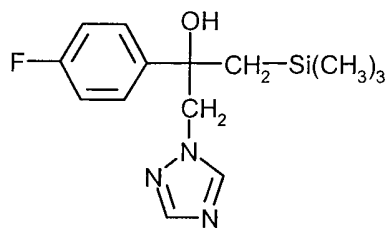
5 (3-12) 下式氟环唑(epoxiconazole)(取自 EP-A 0 196 038)



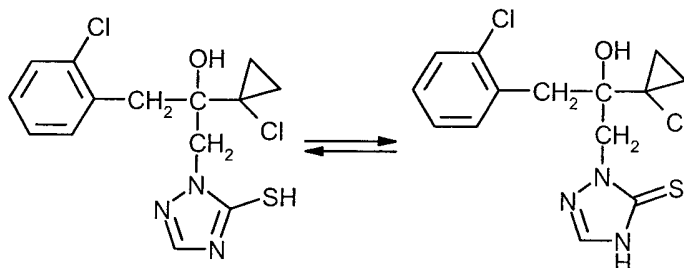
(3-13) 下式氟矽唑(flusilazole)(取自 EP-A 0 068 813)



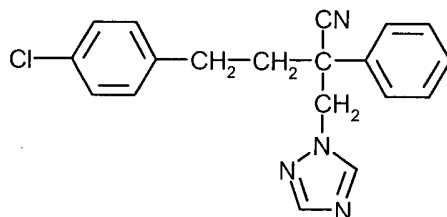
(3-14) 下式矽氟唑(simeconazole)(取自 EP-A 0 537 957)



(3-15) 下式丙硫菌唑(prothioconazole)(取自 WO 96/ 16048)

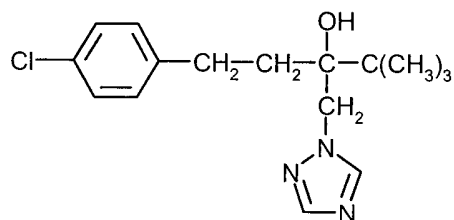


(3-16) 下式丙腈苯唑(fenbuconazole)(取自 DE-A 37 21 786)

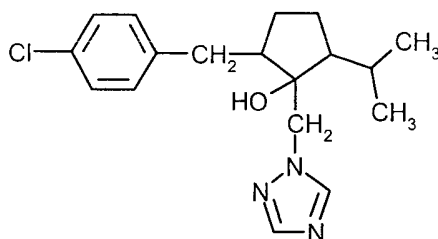


5

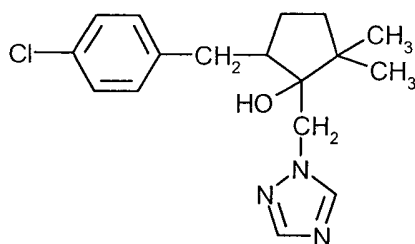
(3-17) 下式戊唑醇(tebuconazole)(取自 EP-A 0 040 345)



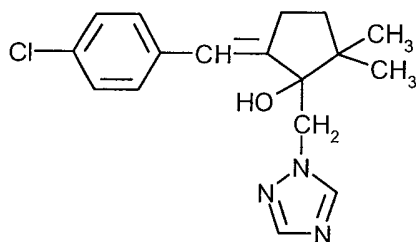
(3-18) 下式種菌唑(ipconazole)(取自 EP-A 0 329 397)



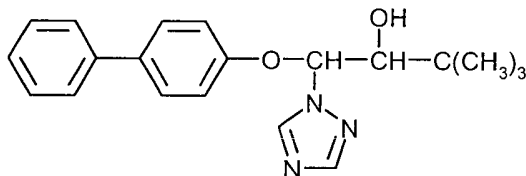
(3-19) 下式葉菌唑(metconazole)(取自 EP-A 0 329 397)



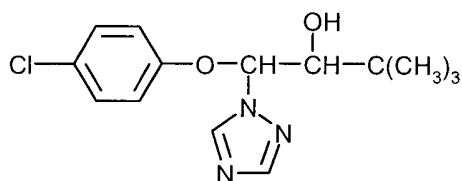
(3-20) 下式滅菌唑(triticonazole)(取自 EP-A 0 378 953)



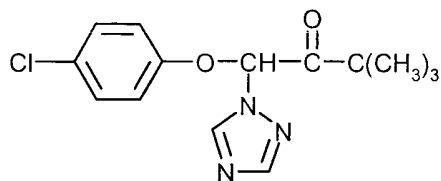
5 (3-21) 下式聯苯三唑醇(bitertanol)(取自 DE-A 23 24 010)



(3-22) 下式三唑醇(triadimenol)(取自 DE-A 23 24 010)



(3-23) 下式三泰芬(triadimefon)(取自 DE-A 22 01 063)



(3-24) 烯唑醇(diniconazole)

(3-25) 烯唑醇-M(diniconazole-M)

(3-26) 氟喹唑(fluquinconazole)

(3-27) 抑黴唑(imazalil)

5 (3-28) 硫酸抑黴唑；以及

(3-29) 撲克拉(prochloraz)和其鹽類及/或混合物；

其中最佳為戊唑醇(107534-96-3)(化學名稱：*(RS)*-1-對氯苯基-4,4-二甲基-3-(1*H*-1,2,4-三唑-1-基甲基)-戊-3-醇)或其鹽類。

10 最佳為 *N*-[2-(1,3-二甲丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醯胺混合下列的共伴物(2)和(3)：

(2-1) 本達樂和選自由(3-1)戊環唑、(3-2)乙環唑、(3-3)丙環唑、(3-4)噁醚唑、(3-5)糠菌唑、(3-6)環丙唑醇、(3-7)己唑醇、(3-8)戊菌唑、(3-9)腈菌唑、(3-10)四
15 氟醚唑、(3-11)粉唑醇、(3-12)氟環唑、(3-13) 氟矽唑、(3-14)矽氟唑、(3-15) 丙硫菌唑、(3-16)丙腈苯唑、(3-17)戊唑醇、(3-18)種菌唑、(3-19)葉菌唑、(3-20)式滅菌唑、(3-21)聯苯三唑醇、(3-22)三唑醇、(3-23)三泰芬、(3-24)烯唑醇、(3-25)烯唑醇
20 -M、(3-26)氟喹唑、(3-27)抑黴唑、(3-28)硫酸抑黴唑、(3-29)撲克拉構成群組的至少一種唑類和其鹽類及/或混合物。

(2-2) 呋霜靈和選自由(3-1)戊環唑、(3-2)乙環唑、(3-3)丙環唑、(3-4)噁醚唑、(3-5)糠菌唑、(3-6)環丙唑醇、(3-7)己唑醇、(3-8)戊菌唑、(3-9)腈菌唑、(3-10)四氟醚唑、(3-11)粉唑醇、(3-12)氟環唑、(3-13) 氟矽唑、(3-14)矽氟唑、(3-15) 丙硫菌唑、(3-16)丙腈苯唑、(3-17)戊唑醇、(3-18) 種菌唑、(3-19)葉菌唑、(3-20)式滅菌唑、(3-21)聯苯三唑醇、(3-22)三唑醇、(3-23)三泰芬、(3-24)烯唑醇、(3-25)烯唑醇-M、(3-26)氟喹唑、(3-27)抑黴唑、(3-28)硫酸抑黴唑、(3-29)撲克拉構成群組的至少一種唑類和其鹽類及/或混合物。

(2-3) 滅達樂和選自由(3-1)戊環唑、(3-2)乙環唑、(3-3)丙環唑、(3-4)噁醚唑、(3-5)糠菌唑、(3-6)環丙唑醇、(3-7)己唑醇、(3-8)戊菌唑、(3-9)腈菌唑、(3-10)四氟醚唑、(3-11)粉唑醇、(3-12)氟環唑、(3-13) 氟矽唑、(3-14)矽氟唑、(3-15) 丙硫菌唑、(3-16)丙腈苯唑、(3-17)戊唑醇、(3-18) 種菌唑、(3-19)葉菌唑、(3-20)式滅菌唑、(3-21)聯苯三唑醇、(3-22)三唑醇、(3-23)三泰芬、(3-24)烯唑醇、(3-25)烯唑醇-M、(3-26)氟喹唑、(3-27)抑黴唑、(3-28)硫酸抑黴唑、(3-29)撲克拉構成群組的至少一種唑類和其鹽類及/或混合物。

(2-4) 滅達樂-M和選自由(3-1)戊環唑、(3-2)乙環唑、(3-3)丙環唑、(3-4)噁醚唑、(3-5)糠菌唑、(3-6)環丙唑醇、

(3-7)己唑醇、(3-8)戊菌唑、(3-9)腈菌唑、(3-10)四
氟醚唑、(3-11)粉唑醇、(3-12)氟環唑、(3-13) 氟
矽唑、(3-14)矽氟唑、(3-15)丙硫菌唑、(3-16)丙腈
苯唑、(3-17)戊唑醇、(3-18)種菌唑、(3-19)葉菌
5 唑、(3-20)式滅菌唑、(3-21)聯苯三唑醇、(3-22)三
唑醇、(3-23)三泰芬、(3-24)烯唑醇、(3-25)烯唑醇
-M、(3-26)氟喹唑、(3-27)抑黴唑、(3-28)硫酸抑黴
唑、(3-29)撲克拉構成群組的至少一種唑類和其鹽類
及/或混合物。

10 根據本發明的“活性化合物組合物”一詞指上述三種活
性化合物的任何可能組合，舉例如預拌物、桶混物(用於配
方前經混合及稀釋各別活性化合物所製備的噴霧混合物)
或其組合(例如，將兩種上述活性化合物之二元預拌物與配
方的第三種物質置入混桶內)。根據本發明，亦可在數小時
15 或數天的合理間隔時間內成功地依次即輪流使用各活性
化合物於處理種籽以及例如施予複數層的不同活性化合
物。各活性化合物的施予順序並不重要。

本發明進一步係關於含有本發明之活性化合物組合
物的組成物。該組成物較佳為含有農業上適合載劑或增容
20 劑的殺真菌組成物。

根據本發明，載劑意指混合或併用活性化合物而更易
施藥於植物或植物部位或種籽的天然或合成或無機物
質。該載劑通常為適用於農業之無活性的固體或液體。

適合的固態載劑為：銨鹽和天然研磨礦粉例如白陶

土、黏土、滑石粉、白堊、石英、脫色白土(attapulgitite)、蒙脫土(montmorillonite)或矽藻土；以及合成礦物例如矽粉、鋁和天然或合成矽酸鹽、樹脂、蠟、固態肥料、水、特別指丁醇的醇類、有機溶劑、礦油和植物油；及其衍生物。亦可使用此類載劑的混合物。適用於顆粒的固態載劑為：磨碎和分餾天然礦物例如方解石(calcite)、大理石、浮石、海泡石(sepiolite)、白雲石(dolomite)，以及亦包括無機和有機合成顆粒和有機礦物顆粒例如鋸屑、椰子殼、玉米芯和煙草梗。適合的乳化劑及/或泡沫形成劑為：非離子和陰離子乳化劑例如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸鹽、烷基硫酸鹽、芳基磺酸鹽，以及蛋白水解產物。適合的分散劑為：亞硫酸紙漿廢液和甲基纖維素。

適合的液化氣體增容劑或載劑為周圍溫度和大氣壓下為氣體的液體例如推噴劑如丁烷、丙烷、氮和二氧化碳。

配方內可使用增黏劑例如羧甲基纖維素以及粉末、顆粒和膠乳狀的天然和合成聚合物如阿拉伯膠、聚乙烯醇、聚醋酸乙烯酯，或天然磷酯例如腦啡(cephalins)和卵磷脂以及合成磷脂。其他可使用的添加物為礦物油和植物油。

若利用水作為增容劑時可使用有機溶劑作為助溶劑。適合的液態溶劑為：芳香化合物例如二甲苯、甲苯或烷基萘；氯化芳香化合物或氯化脂族烴例如環己烷或石蠟如礦油分餾物；礦物油和植物油；醇例如丁醇或甘醇及其醚或酯；酮例如丙酮、甲乙酮、甲基異丁基酮或環己酮；

強極性溶劑例如二甲基甲醯胺和二甲亞砷；以及水。

根據本發明的組成物進一步可含有其他的成分，舉例如表面活性劑。適合的表面活性劑為具有離子或非離子性質的乳化劑、分散劑或濕潤劑，或這些表面活性劑的混合物。這些鹽類的實例為聚丙烯酸鹽、木素磺酸鹽、苯磺酸鹽或萘磺酸鹽；氧化甲烯與脂肪醇或脂肪酸或脂肪胺的縮聚物；經取代苯酚(較佳為烷基酚或芳基酚)；琥珀磺酸酯之鹽；牛磺酸衍生物(較佳為烷基牛磺酸)；聚乙氧化醇或苯酚的磷酸酯；多元醇的脂肪酸酯；以及含有硫酸鹽、磺酸鹽和磷酸鹽之化合物的衍生物。當其一活性化合物及/或其一無活性載劑不溶於水以及利用水進行施藥時必需添加表面活性劑。本發明組成物內的表面活性劑含量為 5 至 40%重量比。

可添加染色劑例如無機色素如氧化鐵、氧化鈦、普魯士藍，以及無機染料例如茜素(alizarin)、偶氮染料和金屬苯二甲藍素；以及微量營養素例如鐵鹽、錳鹽、硼鹽、鈷鹽、鉬鹽和鋅鹽。

需要時亦可加入其他的成分例如保護膠體、黏合劑、黏著劑、增稠劑、觸變劑、滲透劑、穩定劑、隔離劑、複合物形成劑。通常，該活性化合物可混合習知配製用途的任何固態或液態添加物。

通常，根據本發明的組成物含有 0.05 至 99%重量比的本發明化合物組合物，較佳為 5 至 60%重量比，更佳為 10 至 50%重量比，最佳為 20%重量比。

根據本發明的活性化合物組合物或組成物視其物理及/或化學性質可使用其配方或製成劑型例如氣化噴霧劑、膠囊懸浮劑、冷霧劑、熱霧劑、微膠囊化顆粒、細顆粒、水懸劑於處理種籽、隨取即用溶液、粉劑、乳化濃縮液、水包油乳劑、油包水乳劑、大粒劑、微粒劑、油分散性粉劑、油懸劑、油溶性液劑、泡沫、糊劑、塗殺蟲劑種籽、懸浮劑、懸浮濃縮劑、可溶性液劑、懸浮劑、可濕性粉末、可溶性粉末、粉末和顆粒、水溶性顆粒或錠劑、用於種籽處理的水溶性粉末、可濕性粉末、浸泡活性化合物的天然產物和合成物質，以及微膠囊化於聚合物內和用於種籽的包覆材料，以及 ULV 冷霧和熱霧配方。

可根據已知的方法製備該配方，例如藉由活性化合物或活性化合物組合物混合至少一種溶劑或稀釋劑、乳化劑、分散劑及/或黏合劑或固定劑、防水劑、乾燥劑和紫外線穩定劑以及需要時混合染料和色素，及進一步加入加工助劑。

利用習知的處理方法例如藉由浸泡、噴灑、霧化、灌溉、蒸發、撲粉、噴霧、撒佈、泡浴、塗佈、播散、澆水(噴淋)、滴灌以活性化合物組合物或組成物直接處理植物和植物部位或置於其周圍環境、棲息地或儲存處，其特別指種籽的播散材料、處理乾燥種籽的粉末、種籽處理溶液、用於漿液處理的水溶性粉末、藉由形成硬皮、藉由塗佈一或多層包膜等。

根據本發明之組成物不僅含有可利用適當裝置被施

予至植物或種籽的即用型組成物亦含有需在使用前以水稀釋的市售濃縮產品。

根據本發明之活性化合物組合物可存在於市售配方及這些配方混合其他活性化合物例如殺蟲劑、誘引劑、消毒劑、殺菌劑、殺蟎劑、殺線蟲劑、殺真菌劑、生長調節劑或除草劑所製成的劑型內。

根據本發明之活性化合物組合物或組成物於作物保護和被保護材料具有強效的殺菌力以及可被用於控制有害微生物例如真菌和細菌。

於作物保護中，殺真菌劑可用於控制根瘤菌、卵菌(Oomycetes)、壺菌(Chytridiomycetes)、接合菌、子囊菌、擔子菌和不完全菌綱(Deuteromycetes)。

於作物保護中，殺菌劑可用於控制假單胞菌、根瘤菌、腸內菌、棒狀桿菌和鏈黴菌。

根據本發明之殺真菌組成物可用於處理或保護性控制植物病原性真菌。因此，本發明亦係關於利用本發明之活性化合物組合物或組成物於控制植物病原性真菌的處理和保護方法，其可被施用於種籽、植物或植物部位、果實或生長的土壤內。

根據本發明，其可被用於處理全部植物和植物部位。此處植物意指全部的植物和植物族群，例如有益和有害野生植物或作物(包括存在於自然界的作物)。作物可為藉由習知育種和最適化方法，或藉由生物技術和基因工程法或這些方法的組合所獲得的植物，包括轉殖基因植物及包括

受或不受各種財產權保護的植物品種。植物部位意指土壤上和土壤下的全部植物部位和器官，例如芽、葉、花和根，可提及的實例為葉、針、莖、幹、花、果實體、果實和種籽以及亦包括根、塊莖和地下莖。植物部位亦包括收獲物及營養性和有性生殖部分，例如幼苗、塊莖、地下莖、切削部分和種籽。

下列為可根據本發明被處理的植物：綿花、亞麻、葡萄、果實、蔬菜例如薔薇科(例如梨果類如蘋果、梨但亦包括核果類如杏桃、櫻桃、杏仁和桃樹以及漿果如草莓)；*Ribesioideae* sp.; 胡桃科；樺木科；漆樹科；殼斗科(*Fagaceae* sp.); 桑科；木犀科(*Oleaceae* sp.); 獼猴桃科(*Actinidaceae* sp.); 樟科；芭蕉科(例如香蕉樹和香蕉園)；茜草科(例如咖啡)；山茶科；梧桐科；芸香科(例如檸檬、桔和柚子)；茄科(例如蕃茄)；百合科；菊科(例如萵苣)；繖形科；十字花科；藜科(*Chenopodiaceae* sp.); 葫蘆科(例如小黃瓜)；蔥科(例如韭菜、洋蔥)；蝶形花科(例如豆類)；主要作物例如禾本科(例如玉米、草坪、穀物如黑麥、稻米、大麥、燕麥、小米和黑小麥)；菊科(例如向日葵)；十字花科(例如高麗菜、紅甘藍、青花菜、花椰菜、芽甘藍、小白菜、大頭菜、蘿蔔以及油菜籽、油菜、芥菜、山葵和水芹)；豆科(例如莢豆、青豆、扁豆、花生)；蝶形花科(例如大豆)；茄科(例如蕃茄)；藜科(例如甜菜、飼用甜菜、葉甜菜、甜菜根)；花園和森林的作物和觀賞植物；以及上述植物的基因改良植物。

用於控制植物病原性真菌的本發明方法亦可用於處理基因改性生物，例如植物或種籽。基因改性植物為其基因組已穩定整合地被編碼入某些蛋白之異源性基因的植物。此處“異源性基因”意指具有新穎農藝性質或可改善改良植物農藝品質之轉殖植物的基因。

如上所述，可根據本發明處理全部植物或其部位。在一較佳具體實施例中，可處理野生植物品種和栽培品種，或藉由習知生物育種法獲得者例如雜交或原生質融合，及其部位。在一更佳具體實施例中，需要時可結合習知的方法(基因改性生物)處理藉由基因工程法獲得的轉殖基因植物和栽培品種，及其部位。“部位”、“植物之部位”和“植物部位”一詞已解釋於上文中。最佳為根據本發明處理市售或通用栽培品種的植物。

視植物品種或栽培品種、其位置和生長條件(土壤、氣候、營養期、食用期)本發明之處理亦可獲得超加成(協同)效應。因此，其產物可超過實際的預期效應例如減少施用率及/或擴大本發明化合物和組成物的作用範圍及/或活性、較佳生長、增加對高或低溫的抗性、增加對乾旱或水或土壤含鹽量的耐力、增加開花性能、易於收穫、加速成熟、較高收穫量、較高品質及/或較高營養價值的產物、較佳貯存穩定性及/或可加工性的產物。

藉由本發明處理的較佳轉殖基因植物或植物品種(獲得自基因工程)包括借助基因改良利用基因物質賦予特定有用性狀的全部植物。此類性狀的實例為較佳生長、增加

對高或低溫的抗性、增加對乾旱或水或土壤含鹽量的耐力、增加開花性能、易於收穫、加速成熟、較高收穫量、較高品質及/或較高營養價值的產物、較佳貯存穩定性及/或可加工性的產物。此類性狀進一步特別強調的實例為植物對抗動物和微生物害蟲的較佳防禦力例如對抗昆蟲、恙蟲、植物病原性真菌、細菌及/或病毒，以及亦增加植物對某些除草劑活性化合物的耐受力。轉殖基因植物的實例為重要作物例如穀類(小麥、稻米)；蔬菜(蕃茄)；玉米；大豆；馬鈴薯；棉花；油菜籽；菜籽；以及亦包括果樹(蘋果、梨、柑橘和葡萄的果實)，以及其特別指稻米、玉米、大豆、馬鈴薯、棉花、蕃茄、菜籽和油菜籽。

N-[2-(1,3-二甲丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醯胺、戊唑醇和滅達樂的混合物特別適用於下類的作物：穀類、玉米、大豆、油菜籽、菜籽、蔬菜(特別指蕃茄)、馬鈴薯、棉花、向日葵、豆科植物(莢豆、青豆、扁豆等)。

此外，*N*-[2-(1,3-二甲丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醯胺、硫菌唑和滅達樂的混合物特別適用於下類的作物：穀類、玉米、大豆、油菜籽、菜籽、蔬菜(特別指蕃茄)、馬鈴薯、棉花、向日葵、豆科植物(莢豆、青豆、扁豆等)。

特別重要的“性狀”為藉由植物內形成對抗昆蟲以增加植物防禦力的毒素，其特別指於植物內形成蘇力菌的基因物質(藉由基因 CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb 和 CryIF 以

及其組合)(下文中稱為“Bt 植物”)。同屬重要的性狀為可增加植物對某些除草劑活性化合物如咪唑啉酮、磺酰脲、嘉磷賽(glyphosate)或磷絲菌素(例如“PAT”基因)的耐受力。賦予所欲性狀的基因亦可在轉殖基因植物內被相互結合。5 “Bt 植物”的實例為玉米品種、棉花品種、大豆品種和馬鈴薯品種其商品名稱為 YIELD GARD[®](例如玉米、棉花、大豆); KnockOut[®](例如玉米); StarLink[®](例如玉米); Bollgard[®](棉花); Nucotn[®](棉花); 以及 NewLeaf[®](馬鈴薯)。除草劑耐受性植物的實例為玉米品種、棉花品種和大豆品10 種, 其商品名稱為 Roundup Ready[®](耐嘉磷賽, 例如玉米、棉花、大豆); Liberty Link[®](耐膦基麥黃酮, 例如油菜籽); IMI[®](耐咪唑啉酮); 以及 STS[®](耐磺酰脲, 例如玉米)。抗除草劑植物(以習知方法培育的耐除草劑植物)包括商品名稱為 Clearfield[®](例如玉米)的品種。當然, 其亦包括具15 有這些基因性狀或待開發基因性狀、將被開發及/或於未來上市的植物品種。

此外, 根據本發明的活性化合物組合物可用於對抗有害真菌之工業材料的保護。工業材料包括例如紙、地毯、建築、冷卻和加熱系統、壁布、絕緣和空調設備。根據本20 發明的活性化合物組合物可預防不良的效應例如腐敗、腐朽、變色、脫色或形成黴菌。

用於控制有害真菌的本發明方法亦可被用於保護儲藏物品。此處儲藏物品意指需長期貯存的植物或動物性天然物質或其加工產品。植物性儲藏物品舉例如莖、葉、塊

莖、種籽、果實、穀粒之新鮮收獲或藉由(預)乾燥、濕化、粉碎、研磨、加壓或烘培加工後的植物或植物部位。儲藏物品亦包括木材、電線桿和絕緣物，或為如傢俱的製成品。動物性的儲藏物品為例如皮、革、毛皮和毛髮。根據本發明的活性化合物組合物具有預防例如腐敗、腐朽、變色、脫色或形成黴菌的效果。

可根據本發明處理之真菌或細菌性病原菌的實例包括但不侷限於：

白粉病菌導致的疾病舉例如

布氏白粉菌屬(*Blumeria*)舉例如小麥白粉菌病；
 又絲單囊殼屬(*Podosphaera*)舉例如蘋果白粉菌病；
 單絲殼屬(*Sphaerotheca*)舉例如瓜白粉菌病；
 鉤絲殼屬(*Uncinula*)舉例如葡萄白粉菌病；

葉銹病菌導致的疾病舉例如

膠銹菌屬(*Gymnosporangium*)舉例如梨葉銹菌病；
 駝孢銹菌屬(*Hemileia*)舉例如咖啡駝孢銹菌病；
 層銹菌屬(*Phakopsora*)舉例如大豆銹菌病和豆薯層銹菌病；
 柄銹菌屬(*Puccinia*)舉例如黑麥葉銹菌病和小麥葉銹菌病；
 單胞銹菌屬(*Uromyces*)舉例如菜豆銹菌病；

卵菌綱(*Oomycetes*)導致的疾病舉例如

盤梗黴屬(*Bremia*)舉例如萵苣露菌病；
 霜黴屬(霜黴屬)舉例如豌豆霜黴菌或十字花科露菌病；
 疫黴菌(*Phytophthora*)舉例如番茄晚疫病菌；

單軸黴屬(Plasmopara)舉例如葡萄霜黴病菌；

假霜黴屬(Pseudoperonospora)舉例如蛇麻露菌病或胡瓜露菌病；

腐黴菌屬(Pythium)舉例如終極腐黴菌；

5 造成黑斑病(leaf blotch)和葉枯病(leaf wilt)例如

交鏈孢菌屬(Alternaria)舉例如蕃茄早疫菌病；

尾孢屬(Cercospora)舉例如尾孢菌葉斑病；

分枝孢子菌屬(Cladosporium)舉例如瓜分枝孢子菌病；

旋孢腔菌屬(Cochliobolus)舉例如小麥斑枯病

10 (芽孢體型：德氏黴菌屬(Drechslera)，異名：長蠕孢屬(Helminthosporium))；

炭疽菌屬(Colletotrichum)舉例如菜豆炭疽菌病；

葉斑菌屬(Cycloconium)舉例如油橄欖孔雀斑病；

間座殼屬(Diaporthe)舉例如柑桔間座殼菌病；

15 囊腔菌屬(Elsinoe)舉例如柑橘痂囊腔菌病；

盤孢子菌屬(Gloeosporium)舉例如桃炭疽病；

小叢殼屬(Glomerella)舉例如菌環小絲殼菌病；

球座菌屬(Guignardia)舉例如葡萄球座菌病；

小球腔菌屬(Leptosphaeria)舉例如十字花科小球腔菌病；

20 子囊菌屬(Magnaporthe)舉例如稻瘟菌病；

球腔菌屬(Mycosphaerella)舉例如小麥斑點病和香蕉黑條葉斑菌病；

針孢菌屬(Phaeosphaeria)舉例如穎枯殼針孢菌病；

核腔菌屬(Pyrenophora)舉例如大麥網斑病；

柱隔孢屬 (Ramularia) 舉例如大麥柱隔孢菌病；

喙孢黴菌屬 (Rhynchosporium) 舉例如黑麥草雲紋喙孢黴菌病；

針孢菌屬 (Septoria) 舉例如芹菜斑枯菌病；

5 核瑚菌屬 (Typhula) 舉例如小麥雪腐菌病；

黑星菌屬 (Venturia) 舉例如蘋果黑星病；

造成根或莖疾病例如

伏革菌屬 (Corticium) 舉例如禾穀伏革菌病；

鐮胞菌屬 (Fusarium) 舉例如黃瓜枯萎菌病；

10 頂囊殼屬 (Gaeumannomyces) 舉例如小麥全蝕菌病；

絲核菌屬 (Rhizoctonia) 舉例如水稻紋枯菌病；

Tapesia 屬舉例如 Tapesia 針形菌病；

串珠黴屬 (Thielaviopsis) 舉例如根腐病；

造成穗或花序疾病例如

15 交鏈孢菌屬 (Alternaria) 舉例如鏈格孢菌病；

麴菌屬 (Aspergillus) 舉例如黃麴菌病；

枝孢菌屬 (Cladosporium) 舉例如枝孢芽枝菌病；

麥角菌屬 (Claviceps) 舉例如麥角菌病；

鐮胞菌屬舉例如黃色鐮胞菌；

20 赤黴菌屬 (Gibberella) 舉例如小麥赤黴菌病；

雪腐梭孢屬 (Monographella) 舉例如小麥雪腐病；

黑粉菌 (smut fungi) 造成的疾病舉例如

軸黑粉菌屬 (Sphacelotheca) 舉例如高粱絲黑穗菌病；

腥黑粉菌屬(*Tilletia*)舉例如小麥黑粉菌病；
條黑粉菌屬(*Urocystis*)舉例如黑麥桿黑穗菌病；
黑粉菌屬(*Ustilago*)舉例如大麥散黑穗病；

造成果腐病例如

- 5 麴菌屬舉例如黃麴菌病；
灰黴菌屬(*Botrytis*)舉例如灰黴病；
青黴菌屬舉例如擴張青黴菌病和產紫青黴菌病；
核盤菌屬(*Sclerotinia*)舉例如油菜菌核病；
輪枝菌屬(*Verticillium*)舉例如苜蓿黃萎菌病；

- 10 種籽-和土傳根腐和凋萎病以及造成幼苗的疾病例如

交鏈孢菌屬舉例如甘藍黑斑病菌；
絲囊黴菌屬(*Aphanomyces*)舉例如豌豆絲囊黴菌病；
殼單孢菌屬(*Ascochyta*)舉例如兵豆褐斑菌病；
麴菌屬舉例如黃麴菌病；

- 15 分枝孢子菌屬(*Cladosporium*)舉例如多主枝孢黴菌病；
旋孢腔菌屬舉例如小麥斑枯病；

(芽孢體型：德氏黴菌屬，異名：長蠕孢屬)；

鐮胞菌屬舉例如黃色鐮胞菌；

赤黴菌屬舉例如小麥赤黴菌病；

- 20 殼球孢屬(*Macrophomina*)舉例如毛豆斑點病；

雪腐梭孢屬舉例如小麥雪腐病；

青黴菌屬舉例如擴張青黴菌病；

暗球腔菌屬(*Phaeosphaeria*)舉例如穎枯殼針孢菌病；

莖點黴菌屬(*Phoma*)舉例如甘藍黑腐病；

擬莖點黴屬 (*Phomopsis*)舉例如大豆莢稈枯腐病；

疫黴菌屬 (*Phytophthora*)舉例如惡疫黴菌病；

核腔菌屬舉例如大麥條紋病；

梨形孢屬 (*Pyricularia*)舉例如稻瘟菌病；

5 腐黴菌屬舉例如終極腐黴菌；

絲核菌屬舉例如水稻紋枯菌病；

根黴菌屬 (*Rhizopus*)舉例如米根黴菌病；

小核菌屬 (*Sclerotium*)舉例如白絹菌病；

核瑚菌屬 (*Typhula*)舉例如小麥雪腐菌病；

10 輪枝菌屬舉例如大麗輪枝菌病；

造成癌症疾病、癭(galls)和簇葉病(Witches' broom)例如
叢赤殼屬 (*Nectria*)舉例如蘋果潰瘍病；

造成枯萎病例如

鏈核盤菌屬 (*Monilinia*)舉例如核果鏈核盤菌病；

15 造成葉、花和果實的變形例如

外囊菌屬 (*Taphrina*)舉例如桃縮葉病；

造成木本植物的退化性疾病例如

*Esca*屬病原菌其中可舉例如 *Phaemoniella clamydospora* 以及
Phaeoacremonium aleophilum 和 *Formitiporia mediterranea*；

20 造成花和種籽的疾病例如

葡萄孢屬 (*Botrytis*)舉例如蕃茄灰黴菌病；

造成植物塊莖的疾病例如

絲核菌屬舉例如水稻紋枯菌病；

長蠕孢屬舉例如馬鈴薯銀腐病；

細菌性病原菌造成的疾病舉例如

黃單胞菌屬(Xanthomonas)舉例如高麗菜水稻黑腐病；

假單胞菌屬(Pseudomonas)舉例如甜瓜細菌性葉斑病菌；

5 歐文氏菌屬(Erwinia)舉例如梨火疫病菌病；

其較佳為可控制下列大豆的疾病：

造成葉、莖、莢和籽的真菌性疾病例如

10 黑斑病(交鏈孢菌)、炭疽病(盤苞菌)、褐斑病(殼針孢菌)、
葉斑病(尾孢菌)、葉枯病(筭黴菌)、葉斑病(棘殼孢菌)、霜
黴病(霜黴菌)、枯萎病(臍蠕孢菌)、灰斑病(尾孢菌)、甘蔗
葉枯病(小球腔菌)、大豆灰星病菌(葉點黴菌)、大豆莢稈
15 枯腐病(擬莖點黴菌)、白粉病(叉絲殼菌)、莖點葉斑病(莖
點黴菌)、絲核菌氣生、葉和立枯病(絲核菌)、銹病(大豆
層銹菌、豆薯層銹菌)、赤黴病(瘡痂菌)、葉枯病(葡根黴
菌)、毛豆紫斑病(棒孢黴菌)；

造成根和莖基部的真菌性疾病例如

20 根黑腐病(麗赤殼菌)；炭腐病(殼球孢菌)；鐮孢菌枯萎病
或萎凋病；根腐病及莢和基腐病(尖孢鐮孢菌、直喙鐮孢
菌、半裸鐮孢菌、木賊鐮孢菌)；Mycoleptodisus 根腐病(大
豆枯萎病菌)；新赤殼菌病(侵脈新赤殼菌)；莢和莖枯病(間
座殼菌)；枝枯病(間座殼菌)；疫黴根腐病(疫黴菌)；褐莖
腐病(絲黴菌)；腐黴菌根腐病(瓜果腐黴菌、畸雌腐黴菌、
德巴利腐黴菌、群結腐黴菌、終極腐黴菌)；絲核菌根腐

病、莖腐敗病和猝倒病(立枯絲核菌)；核盤菌莖腐敗病(核盤菌)；白絹病(菌核病菌)、串株黴根腐病(串珠黴菌)。

本發明活性化合物組合物的施用量為

- 施藥濃度：從 0.1 至 10 000 克/畝，較佳為從 10 至 1 000 克/畝，更佳為從 50 至 300 克/畝(在澆水或浸泡的施用中若使用礦棉或珍珠岩(perlite)時可減少施用量)；
- 用於種籽處理時：每 100 公斤種籽從 0.01 至 200 克，較佳為每 100 公斤種籽從 0.1 至 150 克，更佳為每 100 公斤種籽從 5 至 25 克；
- 灑佈於土壤時：從 0.1 至 10 000 克/畝，較佳為從 1 至 5 000 克/畝。

上述施用量僅用於實例之說明本發明非僅侷限於該範圍內。

本發明之活性化合物組合物或組成物因此可在處理後一段時間用於對抗上述病原菌的植物保護作用。以活性化合物處理植物後的保護期間通常可達 1 至 28 天，較佳為 1 至 14 天，或種籽處理後可高至 200 天。

亦可利用本發明活性化合物組合物或組成物製備用於處理或保護性處理人類或動物對抗真菌性疾病如真菌病、皮膚病、髮癬菌病和念珠菌病或麴菌如薰煙色麴菌造成的疾病。

此外，藉由本發明的處理可減少收成產品以及食品和其製成飼料的真菌毒素含量。其特別指但非專指下列的真

菌毒素：脫氧瓜萎鏽菌醇(DON)、瓜萎鏽菌醇(nivalenol)、
15-Ac-DON、3-Ac-DON、T2-和 HT2-毒素、伏馬菌素
(fumonisine)、赤黴烯酮(zearalenon)、串珠鏽刀菌素(monili-
formin)、鏽菌素(fusarin)、蛇形菌素(DAS)、白僵菌素
5 (beauvericin)、恩鏽孢菌素(enniatin)、鏽孢菌增殖素(fusaro-
proliferin)、福斯利諾(fusarenol)、赭曲黴毒素(ochratoxin)、
棒曲黴素(patulin)、麥角生物鹼和下列真菌的黃麴毒素產
物例如鏽胞菌屬如山楊根腐病菌、燕麥鏽孢菌、克地鏽孢
菌、黃色鏽孢菌、禾穀鏽孢菌(小麥赤黴菌)、木賊鏽孢菌、
10 水稻惡苗菌、香焦鏽孢菌、尖鏽孢菌、再育鏽刀菌、早熟
禾鏽孢菌、假禾穀鏽孢菌、接骨木鏽孢菌、蔗草鏽孢菌、
半裸鏽孢菌、茄形鏽胞菌、擬枝孢鏽刀菌、美麗鏽刀菌、
膠孢鏽孢菌、三線鏽刀菌、輪狀鏽孢菌，其特別指麴菌屬、
青黴菌屬、麥角病菌(*Claviceps purpurea*)、黑黴菌屬
15 (*Stachybotrys*)。

本發明進一步包括將各別活性化合物同時施予至種
籽之處理種籽的方法。此外，本發明包括依序將各別活性
化合物施予至種籽之處理種籽的方法。此外，本發明包括
先施予一活性化合物再施予其他兩種活性化合物之二元
20 混合物的種籽處理方法。或者，種籽亦可先施予該二元混
合物接著施予其餘個別的活性化合物。該活性化合物及/
或個別活性化合物及二元混合物若分開施予時，其較佳為
在不同層上進行。這些層可被無活性化合物的隔離層所分
開。

本發明進一步係關於根據上文中所述的其一方法處理種籽。

5 本發明之活性化合物組合物或組成物特別適合用於種籽的處理。有害生物對作物造成最大損害為在種籽貯藏或植物播種的發芽期間或發芽後。由於生長中植物的根和芽極為敏感甚至極微小的損傷仍會造成植物的死亡故為關鍵期。因此，較佳為利用適當組成物保護種籽及發芽植物。

10 很早以前即知道藉由處理植物種籽的方法控制植物病原性真菌，並且仍在持續被改良之中。然而，種籽的處理仍遇到許多無法克服的困難。因此，較佳為於播種或植物發芽後額外施予作物保護劑或至少可大量減少施用量的種籽和發芽植物保護法。進一步較佳為最佳化活性化合物用量而使種籽和發芽植物本身在不受活性化合物損害
15 之下獲得對植物病原性真菌的最大保護效果。明確而言，用於處理種籽的方法亦必需考慮轉殖基因植物的原始殺真菌性質而使用最低量的作物保護劑以達到種籽和發芽植物的最適當保護效果。

20 因此，本發明亦特別係關於利用本發明組成物處理種籽以對抗植物病原性真菌攻擊的種籽和發芽植物保護方法。本發明亦係關於本發明組成物於種籽處理以保護種籽和發芽植物對抗植物病原性真菌的用途。此外，本發明係關於本發明組成物於對抗植物病原性真菌的種籽處理法。

主要以作物保護組成物處理土壤及植物出土部分以

進行損傷發芽後植物之植物病原性真菌的控制。鑑於作物保護組成物可能對環境和人畜健康造成的損害，因此需儘量降低活性化合物的用量。由於本發明組成物的特殊系統性控制性質，本發明的一項優點為經這些組成物處理的種籽不僅種籽本身可獲得保護亦可保護發芽後植物不受植物病原性真菌的攻擊。依此方式，可在播種時或緊接著播種後立即處理該作物。

本發明組成物的另一項優點為可用於轉殖基因種籽，該種籽長出的植物能表現對抗害蟲的蛋白質。利用本發明之活性化合物組合物或組成物處理此類表現例如殺蟲蛋白的種籽可控制某些害蟲。進一步驚奇地發現，其具有協同作用而可增強對抗害蟲的保護效果。

本發明組成物適合用於保護各種農業上、溫室內、森林內或園藝學或果樹栽培上的任何植物。明確而言，其施用的種籽可用於玉米、花生、油菜、蕁薹、罌粟、橄欖、椰子、可可、大豆、莖菜(例如莖菜和甜菜)、稻米、小米、小麥、大麥、裸麥、燕麥、棉、馬鈴薯、向日葵、甘蔗、煙草、豌豆、咖啡、蔬菜(例如蕃茄、小黃瓜、洋蔥和萵苣)、豆科植物(豌豆、青豆、扁豆)，草坪和觀賞植物。

如前所述，特別重要為利用本發明的活性化合物組合物或組成物處理轉殖基因種籽。此指含有可表現殺蟲性質之至少一異性基因多肽或胜肽的植物種籽。該轉殖基因種籽內的異性基因可來自微生物例如桿菌、根瘤菌、假單胞菌、沙雷氏菌(*Serratia*)、木黴菌、棒形桿菌(*Clavibacter*)、

球囊黴菌(*Glomus*)或黏帚黴菌(*Gliocladium*)。此異性基因較佳為來自具有對抗歐洲玉米螟蟲及/或西方玉米根蟲之活性基因的桿菌。該異性基因更佳為來自蘇金雲桿菌(*Bacillus thuringiensis*)。

5 本發明的活性化合物組合物或組成物以其本身或於適當配方內被施予至種籽。該種籽較佳為於穩定狀態下被處理而該處理不造成任何的損傷。通常，在收穫和播種期間內的任何時間點處理該種籽。該種籽一般與植物分開以及不含有果實的芯、殼、莖、皮、毛或肉。

10 因此，可使用例如已被收割、清潔及乾燥至低於15%重量比水分的種籽。或者，亦可使用已於乾燥後經水處理然後再乾燥的種籽。

15 處理種籽時，選擇的本發明組成物及/或其他添加劑含量必需對發芽種籽無不良效應或不傷害及育成植物。必需小心使用於某些施用量具有植物毒性效應的活性化合物。

20 可直接施用本發明的組成物，亦即不含有其他的成分及不進一步稀釋。通常，較佳為在適當的配方內將該組成物施予至種籽。熟習本技術者已習知處理種籽的適當配方和方法以及其述於例如下列的文件中：US 4,272,417 A、US 4,245,432 A、US 4,808,430 A、US 5,876,739 A、US 2003/0176428 A1、WO 2002/080675 A1、WO 2002/028186 A2。

 藉由下列實例說明本發明活性化合物組合物的強效殺真菌活性。同時各別活性化合物具有較弱的殺真菌活性

而組合物則具有較強的活性。

根據 S.R. Colby(“計算除草劑組合物的協同和拮抗反應”，Weeds 1967，15：20~22)計算已知 2 或 3 種活性化合物組合物在殺真菌劑中活性化合物組合物大於預期殺真菌活性的協同效應。

若

X 為 m 克/畝活性化合物 A 施用量的效力；

Y 為 n 克/畝活性化合物 B 施用量的效力；

E_1 分別為 m 和 n 克/畝活性化合物 A 和 B 施用量的效力；

以及

E_2 分別為 m、n 和 r 克/畝活性化合物 A、B 和 C 施用量的效力；

則

$$E_1 = X + Y - \frac{X \cdot Y}{100}$$

或

$$E_2 = X + Y + Z - \frac{X \cdot Y + X \cdot Z + Y \cdot Z}{100} + \frac{X \cdot Y \cdot Z}{10000}$$

此處，以%測定其效力。0%意指對照組的效力，同時 100%意指未受感染時的效力。

若實際的殺真菌活性大於此計算值時，則表示該組合物具有協同效果的超加活性。此時，實際觀察效力必定大於利用上式測得的預期效力 E_1 。

藉由下列實例說明本發明。(然而，本發明並非僅侷限於該實例)。

【實施方式】

立枯絲核菌試驗(體外)/微滴定盤

5 利用馬鈴薯葡萄糖肉汁(PDB)作為液體培養基進行微
滴定盤內的測試。利用溶解於甲醇內的技術級活性化合物。
培養時，使用立枯絲核菌的菌絲體懸浮液。利用分光
光度計測定微滴定盤內在黑暗和振盪(10 赫)下接種 5 天後
的各孔透明度。

此處，0%意指對照組生長的效力，同時 100%意指無
真菌下生長的效力。

10 下表清礎顯示本發明活性化合物組合物的活性大於
計算的活性，亦即具有協同的活性。

表 1

立枯絲核菌試驗(體外)/微滴定試驗

已知活性化合物		活性化合物 ppm 施用量	%效力	
N-[2-(1,3-二甲丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺和滅達樂		0.2	64	
戊唑醇		0.1	13	
本發明的混合物：				
	混合比率	活性化合物 ppm 施用量	實際 效力	利用 Colby's 公式 計算的預期值
N-[2-(1,3-二甲丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺和滅達樂+戊唑醇	2:1	0.2 + 0.1	82	69

穎枯殼小球腔菌(L. nodorum)試驗(小麥)/保護

溶劑： 50份重量比的 *N,N*-二甲基乙醯胺

乳化劑： 1份重量比的烷基芳基聚乙二醇醚

5 將1份重量比的活性化合物混合所述量的溶劑和乳化劑以製備適合的活性化合物，及以水將濃縮液稀釋至所欲的濃度。

10 測定其保護活性時，依所述的施用量將活性化合物製劑噴灑於植物幼苗。於乾燥之後，噴灑穎枯殼小球腔菌的孢子懸浮液。在 20°C 和 100%相對濕度的培養箱內將該植物培養 48 小時。

將該植物置入約 20°C 溫度和 80%相對濕度的溫室內。

在接種後第 10 天進行測定。此處，0%意指對照組的效力，同時 100%意指未受感染時的效力。

15

表 2

穎枯殼小球腔菌試驗(小麥)/保護

活性化合物	克/畝活性化合物 施用量	%效力	
		測定*	計算**
(I) <i>N</i> -[2-(1,3-二甲丁基)苯基]-5- 氟-1,3-二甲基-1 <i>H</i> -吡唑-4-甲 醯胺	62.5	0	
(II) 戊唑醇	62.5	56	
(III) 滅達樂	125	11	
(I) + (II) 1:1	62.5 + 62.5	78	56
(I) + (III) 1:2	62.5 + 125	22	11
(II) + (IV) 1:2	62.5 + 125	78	60
(I) + (II) + (III) 1:1:2	62.5 + 62.5 + 125	89	60

* 測定=測得的活性

** 計算=利用 Colby's 公式計算的活性

網斑內臍蠕孢菌(*P. trers*)試驗(大麥)/保護

溶劑： 50份重量比的 *N,N*-二甲基乙醯胺

乳化劑： 1份重量比的烷基芳基聚乙二醇醚

5 將1份重量比的活性化合物或活性化合物組合物混合
所述量的溶劑和乳化劑以製備適合的活性化合物，及以水
將濃縮液稀釋至所欲的濃度，或以水將市售配方的活性化
合物或活性化合物組合物稀釋至所欲的濃度。

10 測定其保護活性時，依所述的施用量將活性化合物製
劑噴灑於植物幼苗。於乾燥之後，噴灑網斑內臍蠕孢菌的
芽孢體懸浮液。在 20°C 和 100%相對濕度的培養箱內將該
植物培養 48 小時。

將該植物置入約 20°C 溫度和 80%相對濕度的溫室內。

15 在接種後第 10 天進行測定。此處，0%意指對照組的
效力，同時 100%意指未受感染時的效力。

表 3

網斑內臍蠕孢菌試驗(大麥)/保護

活性化合物	克/畝活性化合物 施用量	%效力	
		測定*	計算**
(I) <i>N</i> -[2-(1,3-二甲丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1 <i>H</i> -吡唑-4-甲醯胺	62.5	67	
(II) 丙硫菌唑	62.5	44	
(III) 滅達樂	62.5	0	
(I) + (II) 1:1	62.5 + 62.5	89	81
(I) + (III) 1:1	62.5 + 62.5	78	67
(II) + (III) 1:1	62.5 + 62.5	67	44
(I) + (II) + (III) 1:1:1	62.5 + 62.5 + 62.5	94	81

* 測定=測得的活性

** 計算=利用 Colby's 公式計算的活性

5

【圖式簡單說明】

無

【主要元件符號說明】

無

五、中文發明摘要：

本發明係關於包含已知殺真菌活性化合物 *N*-[2-(1,3-二甲基丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醯胺、滅達樂和三唑(3)的新穎活性化合物組合物，其極適合用於控制不欲的植物病原性真菌。此外，本發明係關於一種治癒或預防性處理植物或有用植物之植物病原性真菌的方法，其特別指非僅處理種籽本身之例如穀物種籽的種籽處理。

六、英文發明摘要：

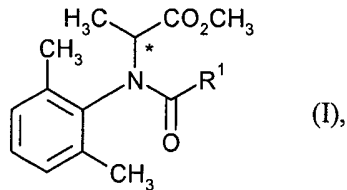
The present invention relates to novel active compound combinations comprising the known fungicidally active compounds *N*-[2-(1,3-dimethylbutyl)phenyl]-5-fluoro-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-4-carboxamide, metalaxyl and triazole (3), which are highly suitable for controlling unwanted phytopathogenic fungi. Moreover, the invention relates to a method for the curative or preventive treatment of phytopathogenic fungi on plants or useful plants, in particular to the treatment of seed, for example seed of cereals, and not least to the treated seed itself.

十、申請專利範圍：

1. 一種活性化合物組合物，其包含：

(1) *N*-[2-(1,3-二甲丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醯胺或其鹽類；以及

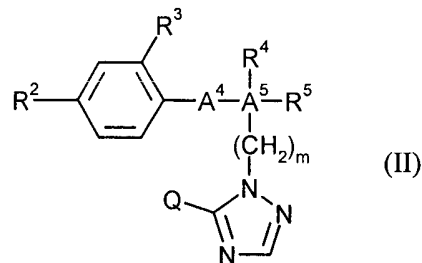
5 (2) 至少一種通式(I)的醯基丙胺酸



其中

* 為 R-或 S-構型中、較佳為 S-構型的碳原子；
 R^1 代表苄基、呋喃基或甲氧甲基，或其鹽；以及

10 (3) 至少一種通式(II)的三唑



其中

Q 代表氫或 SH；

m 代表 0 或 1；

15 R^2 代表氫、氟、氯、苯基或 4-氯苯氧基；

R^3 代表氫或氯；

A^4 代表直接鍵、 $-CH_2-$ 、 $-(CH_2)_2-$ 或 $-O-$ ；

A^4 進一步代表 $^*-CH_2-CHR^{17}-$ 或 $^*-CH=CR^{17}-$ ，其中

*鍵係連接至苯環，其 R^{15} 和 R^{17} 共同代表 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]-$ 或 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)_2-$ ；

A^5 代表 C 或 Si(矽)；

R^4 代表氫、羥基或氰基；

5 R^5 代表 1-環丙乙基、1-氯環丙基、 $C_1\sim C_4$ -烷基、 $C_1\sim C_6$ -羥烷基、 $C_1\sim C_4$ -烷羰基、 $C_1\sim C_2$ -鹵烷氧基- $C_1\sim C_2$ -烷基、三甲基矽烷基- $C_1\sim C_2$ -烷基、單氟苯基或苯基；

10 R^4 和 R^5 進一步共同代表 $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{R}^6)-\text{O}-$ 、 $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{R}^6)-\text{CH}_2-$ 或 $-\text{O}-\text{CH}-(2\text{-氯苯基})-$ ；

R^6 代表氫、 $C_1\sim C_4$ -烷基或溴，或其鹽類。

2. 如申請專利範圍第 1 項之活性化合物組合物，其中每份三唑(3)重量比使用 0.005~500 份重量比的醯基丙胺酸(2)和 0.005~500 份重量比的 *N*-[2-(1,3-二甲基丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醯胺。
- 15 3. 如申請專利範圍第 1 或 2 項之活性化合物組合物，其中該醯基丙胺酸(2)係選自由(2-1)本達樂、(2-2)呋霜靈、(2-3)滅達樂、(2-4)滅達樂-M 構成的群組。
4. 如申請專利範圍第 1 至 3 項中任一項之活性化合物組
- 20 合物，其中該三唑(3)係選自由(3-1)戊環唑、(3-2)乙環唑、(3-3)丙環唑、(3-4)噁醚唑、(3-5)糠菌唑、(3-6)環丙唑醇、(3-7)己唑醇、(3-8)戊菌唑、(3-9)腈菌唑、(3-10)四氟醚唑、(3-11)粉唑醇、(3-12)氟環唑、(3-13)氟矽唑、

(3-14)矽氟唑、(3-15)丙硫菌唑、(3-16)丙腈苯唑、(3-17)戊唑醇、(3-18)種菌唑、(3-19)葉菌唑、(3-20)式滅菌唑、(3-21)聯苯三唑醇、(3-22)三唑醇、(3-23)三泰芬、(3-24)烯唑醇、(3-25)烯唑醇-M、(3-26)氟喹唑、(3-27)抑黴唑、(3-28)硫酸抑黴唑、(3-29)撲克拉和其鹽類及/或混合物構成的群組。

- 5
- 10
- 15
- 20
5. 如申請專利範圍第 1 至 4 項中任一項之活性化合物組合物，其中該醯基丙胺酸(2)係選自由滅達樂和滅達樂-M 構成的群組以及該三唑(3)係戊唑醇。
 6. 如申請專利範圍第 1 至 5 項中任一項之活性化合物組合物，其具有殺真菌活性。
 7. 一種含有如申請專利範圍第 1 至 6 項中任一項之活性化合物組合物的組成物。
 8. 如申請專利範圍第 7 項之組成物，其進一步含有輔助劑、溶劑、載劑、表面活性劑或增效劑。
 9. 一種用於作物保護或保護材料中控制植物病原性真菌的方法，其特徵為將如申請專利範圍第 1 至 6 項中任一項之活性化合物組合物或如申請專利範圍第 7 或 8 項之組成物施予至該種籽、該植物、植物果實或植物生長或用於支持生長的土壤。
 10. 如申請專利範圍第 9 項之方法，其特徵為同時或依序施予該活性化合物(1)、(2)和(3)。

11. 如申請專利範圍第 9 或 10 項之方法，其特徵為使用 0.1 至 10 000 克/畝處理葉子、每 100 公斤種子使用 0.01 至 200 克處理種籽以及使用 0.1 至 10 000 克/畝處理土壤。
- 5 12. 一種如申請專利範圍第 1 至 6 項中任一項之活性化合物組合物或如申請專利範圍第 7 或 8 項之組成物用於作物保護或保護材料中控制不欲之植物病原性真菌的用途。
- 10 13. 一種如申請專利範圍第 1 至 6 項中任一項之活性化合物組合物或如申請專利範圍第 7 或 8 項之組成物於處理種籽的用途。
14. 一種如申請專利範圍第 1 至 6 項中任一項之活性化合物組合物或如申請專利範圍第 7 或 8 項之組成物於處理轉殖基因植物的用途。
- 15 15. 一種如申請專利範圍第 14 項於處理轉殖基因植物種籽的用途。
16. 一種利用如申請專利範圍第 1 至 6 項中任一項之活性化合物組合物或如申請專利範圍第 7 或 8 項之組成物處理的種籽。

七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第(無)圖。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

無

5

10

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

無

15