



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公告本

(11)證書號數：TW I873105 B

(45)公告日：中華民國 114 (2025) 年 02 月 21 日

(21)申請案號：108139931

(22)申請日：中華民國 108 (2019) 年 11 月 04 日

(51)Int. Cl. : C07D239/47 (2006.01)

A01N43/54 (2006.01)

A01N25/02 (2006.01)

A01N25/04 (2006.01)

A01N25/12 (2006.01)

A01N25/30 (2006.01)

A01P3/00 (2006.01)

(30)優先權：2018/11/05 美國

62/755,866

(71)申請人：以色列商亞達瑪馬克天辛有限公司 (以色列) ADAMA MAKHTESHIM LTD. (IL)
以色列貝爾謝巴市郵政信箱 60 號(72)發明人：雪巴泰 沙米 SHABTAI, SAMI (IL)；雪佛 諾姆 SHEFFER, NOAM (IL)；亞德尼
珍妮 勒那 YARDENI, JENNY LERNER (IL)；史隆 詹姆士 SLOAN, JAMES
(GB)

(74)代理人：陳長文

(56)參考文獻：

TW 201945344A

US 8263603B2

US 9850215B2

WO 2017/072166A1

審查人員：蔡榮哲

申請專利範圍項數：59 項 圖式數：10 共 163 頁

(54)名稱

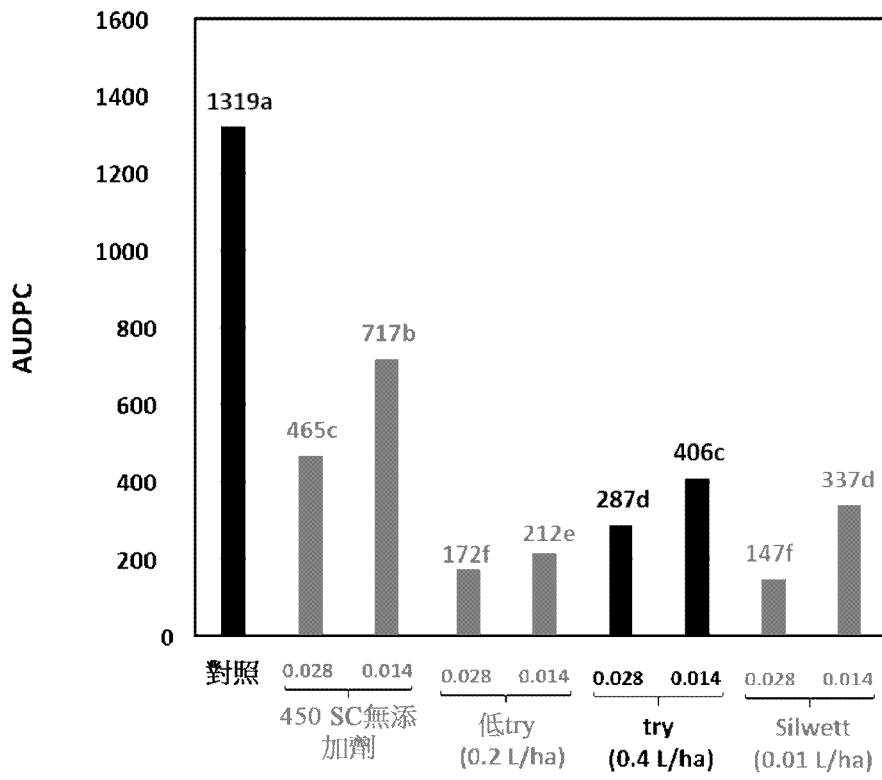
包括 5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-甲苯磺醯基-3,4-二氫嘧啶-2-酮之混合物及組合物，以及其使用方法

(57)摘要

本發明提供穩定的液體組合物，其包括(a)一殺真菌有效量之一式 I 化合物及(b)一液體載體。本發明亦提供混合物及組合物，其包括(a)一殺真菌有效量之一式 I 化合物及(b)選自由以下組成之群組之至少一種佐劑：(i)聚氧化烯烷基醚；(ii)矽氧烷聚氧化烯共聚物；(iii)脂肪酸酯；(iv)乙烯吡咯啶酮及其衍生物；及(v)糖界面活性劑。本發明亦提供本文所揭示之所述混合物及所述組合物之使用方法，及本文所揭示之所述混合物及所述組合物之製備方法。

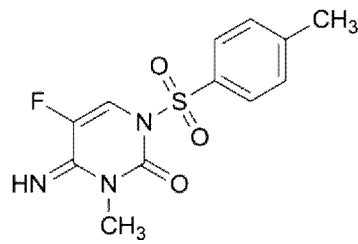
The present invention provides stable, liquid compositions comprising (a) a fungicidally effective amount of a compound of Formula I and (b) a liquid carrier. The present invention also provides mixtures and compositions comprising (a) a fungicidally effective amount of a compound of Formula I and (b) at least one adjuvant selected from the group consisting of: (i) polyalkylene oxide alkyl ether; (ii) siloxane polyalkyleneoxide copolymer; (iii) esters of fatty acid; (iv) vinylpyrrolidones and derivatives thereof; and (v) sugar-based surfactants. The present invention also provides methods of use of the mixtures and compositions disclosed herein and processes of preparing the mixtures and compositions disclosed herein.

指定代表圖：



【圖1】

特徵化學式：



式I



I873105

【發明摘要】

公告本

【中文發明名稱】

包括5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-甲苯磺醯基-3,4-二氫嘧啶-2-酮之混合物及組合物，以及其使用方法

【英文發明名稱】

MIXTURES AND COMPOSITIONS COMPRISING 5-FLUORO-4-IMINO-3-METHYL-1-TOSYL-3,4-DIHYDROPYRIMIDIN-2-ONE, AND METHODS OF USE THEREOF

【中文】

本發明提供穩定的液體組合物，其包括(a)一殺真菌有效量之一式I化合物及(b)一液體載體。本發明亦提供混合物及組合物，其包括(a)一殺真菌有效量之一式I化合物及(b)選自由以下組成之群組之至少一種佐劑：(i)聚氧化烯烷基醚；(ii)矽氧烷聚氧化烯共聚物；(iii)脂肪酸酯；(iv)乙烯吡咯啶酮及其衍生物；及(v)糖界面活性劑。本發明亦提供本文所揭示之所述混合物及所述組合物之使用方法，及本文所揭示之所述混合物及所述組合物之製備方法。

【英文】

The present invention provides stable, liquid compositions comprising (a) a fungicidally effective amount of a compound of Formula I and (b) a liquid carrier. The present invention also provides mixtures and compositions comprising (a) a fungicidally effective amount of a compound of Formula I and (b) at least one adjuvant selected from the group consisting of: (i) polyalkylene oxide alkyl ether;

(ii) siloxane polyalkyleneoxide copolymer; (iii) esters of fatty acid; (iv) vinylpyrrolidones and derivatives thereof; and (v) sugar-based surfactants. The present invention also provides methods of use of the mixtures and compositions disclosed herein and processes of preparing the mixtures and compositions disclosed herein.

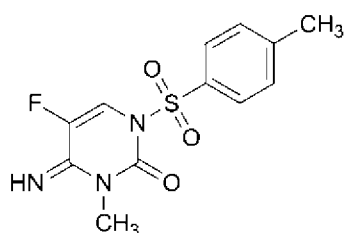
【指定代表圖】

圖1

【代表圖之符號簡單說明】

無

【特徵化學式】



式I

【發明說明書】

【中文發明名稱】

包括5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-甲苯磺醯基-3,4-二氫嘧啶-2-酮之混合物及組合物，以及其使用方法

【英文發明名稱】

MIXTURES AND COMPOSITIONS COMPRISING 5-FLUORO-4-IMINO-3-METHYL-1-TOSYL-3,4-DIHYDROPYRIMIDIN-2-ONE, AND METHODS OF USE THEREOF

【技術領域】

【先前技術】

【0001】 殺真菌劑為天然或合成來源之化合物，其用於保護植物免於由真菌引起的損害。目前之農業方法很大程度上依賴於使用殺真菌劑。實際上，一些作物在不用殺真菌劑之情況下不能有效地生長。使用殺真菌劑使得種植者提高作物之產量及品質，且因此提高作物之價值。在大多數情況下，作物之增加價值至少相當於使用殺真菌劑成本的三倍。

【0002】 5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-甲苯磺醯基-3,4-二氫嘧啶-2(1H)-酮(式I化合物)為一種殺真菌劑，其提供對影響重要經濟作物之各種病原體及由子囊菌及擔子菌類引起之疾病之控制，所述病原體包含(但不限於)小麥葉斑病之致病因子、小麥葉枯病菌(*Zymoseptoria tritici*)、(SEPTTR)。

【0003】 在2012年9月11日頒予之美國專利第8,263,603號中，描述經N3取代之N1-磺醯基-5-氟嘧啶酮衍生物作為殺真菌劑之用途，所述文獻之內容以全文引用之方式併入本文中。在2017年12月26日頒予之美國

專利第9,850,215號及2017年12月12日頒予之美國專利第9,840,476號中，描述5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-甲苯磺醯基-3,4-二氫嘧啶-2(1H)-酮之製備方法，其中之每一者之內容以全文引用之方式併入本文中。

【0004】 美國專利第8,263,603號亦描述用於控制或預防真菌攻擊之殺真菌組合物，其包括經N3取代之N1-磺醯基-5-氟嘧啶酮衍生物及植物學上可接受之載體材料；及其使用方法。

【0005】 殺真菌組合物在各種條件下頻繁地施用及/或與諸如佐劑及肥料之其他添加劑一起施用。因此，殺真菌組合物在製備、儲存及施用過程期間必須呈現極佳化學穩定性及高水準之物理穩定性。

【0006】 在農業中，通常在使用之前用水稀釋組合物。液體組合物更易於稀釋及分散於水中。

【0007】 目前，本領域中無針對5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-甲苯磺醯基-3,4-二氫嘧啶-2(1H)-酮之可用的穩定液體組合物。鑒於5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-甲苯磺醯基-3,4-二氫嘧啶-2(1H)-酮在控制及/或預防真菌攻擊植物上之非凡功效，本領域中顯著需要一種包括5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-甲苯磺醯基-3,4-二氫嘧啶-2(1H)-酮之穩定的液體組合物。

【0008】 有時，殺真菌劑之生物活性及功效由於各種原因而受到限制，所述原因諸如快速漂移、進入葉片之有限滲透及高表面張力/低擴散。活性化合物之功效可藉由添加佐劑來影響及增強。

【0009】 佐劑為惰性化學品，添加其以用於增加活性成分及其組合物之效能。佐劑影響活性成分吸收之條件及其遞送特性，此導致活性成分之功效增加及其活性增強。舉例而言，佐劑可增強活性成分之功效；例如調節噴霧溶液之特性以改良殺真菌劑於葉片上之沈積。

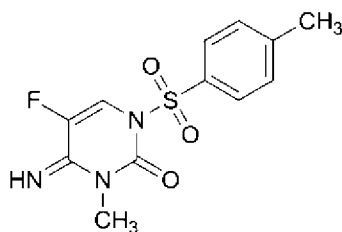
【0010】 使用適合於活性成分及其組合物之佐劑通常決定了活性成分是否可使用且可在施用之後發揮其全部功效。需要佐劑來增加用於葉片表面上吸收之「可用」材料之儲集。此類佐劑通常為非離子性界面活性劑或各種類型之油。

【0011】 美國專利第8,263,603號揭示，包括其中描述之經N3取代之N1-磺醯基-5-氟嘧啶酮衍生物之調配物可另外含有佐劑界面活性劑，來增強化合物沈積、潤濕及滲透至目標作物及生物體上。對美國專利第8,263,603號進行改良，本申請之發明人發現，所選擇佐劑對增強5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-甲苄磺醯基-3,4-二氫嘧啶-2(1H)-酮之殺真菌功效尤其有效。

【發明內容】

【0012】 本發明提供一種穩定的液體組合物，其包括：

(a) 殺真菌有效量之式I化合物：



式I ， 及

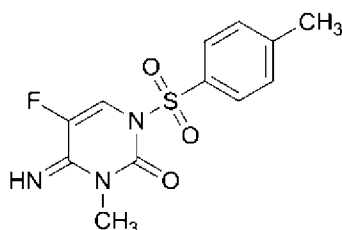
(b) 液體載體。

【0013】 在一些實施例中，式I化合物在液體載體中之溶解度小於5000 ppm。在一些實施例中，式I化合物在液體載體中之溶解度小於1000 ppm。在一些實施例中，組合物包括至少一種穩定化界面活性劑。在一些實施例中，在水存在下，組合物之pH值在5至7.5之範圍內。在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物具有小於0.5重量%之含水量。在一

些實施例中，組合物具有至少500 cP(或以mPa•s為單位)之黏度。在一些實施例中，組合物具有500 cP - 3000 cP之黏度。

【0014】 本發明提供一種殺真菌混合物，其包括：

(a) 殺真菌有效量之式I化合物：



式I ; 及

(b) 選自由以下組成之群組之至少一種佐劑：

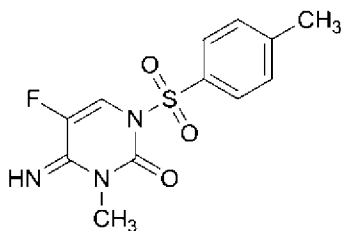
- (i) 聚氧化烯烷基醚；
- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；
- (iv) 乙烯吡咯啉酮及其衍生物；及
- (v) 糖基界面活性劑。

【0015】 本發明亦提供一種用於控制及/或預防真菌病原體攻擊植物之方法，其包括向土壤、植物、根、葉、種子、真菌之部位及/或待預防感染之部位施用本文所描述之組合物或混合物中之任一者，從而控制及/或預防真菌病原體攻擊植物。

【0016】 本發明亦提供一種用於控制及/或預防植物及/或土壤真菌疾病之方法，其包括向土壤、植物、根、葉、種子、真菌之部位及/或待預防感染之部位施用本文所描述之組合物或混合物中之任一者，從而控制及/或預防植物及/或土壤真菌疾病。

【0017】 本發明亦提供一種控制及/或預防真菌病原體攻擊植物之方

法，其包括向土壤、植物、根、葉、種子、真菌之部位及/或待預防感染之部位施用殺真菌有效量之具有式(I)之化合物：



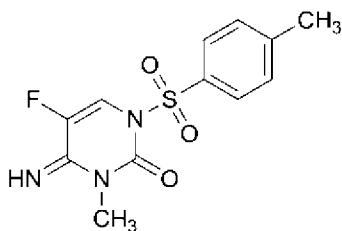
式I

；

及至少一種佐劑，從而控制及/或預防真菌病原體攻擊植物，其中佐劑係選自由以下組成之群組：

- (i) 聚氧化烯烷基醚；
- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；
- (iv) 乙烯吡咯啉酮及其衍生物；及
- (v) 糖基界面活性劑。

【0018】 本發明亦提供一種控制及/或預防植物及/或土壤真菌疾病之方法，其包括向土壤、植物、根、葉、種子、真菌之部位及/或待預防感染之部位施用殺真菌有效量之具有式(I)之化合物：



式I

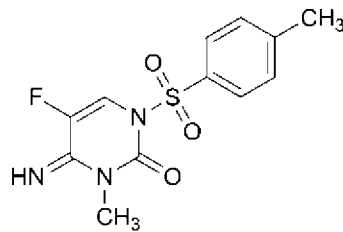
；

及至少一種佐劑，從而控制及/或預防植物及/或土壤真菌疾病，其中佐劑係選自由以下組成之群組：

- (i) 聚氧化烯烷基醚；

- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；
- (iv) 乙烯吡咯啉酮及其衍生物；及
- (v) 糖基界面活性劑。

【0019】 本發明提供一種用於改良一式I化合物針對真菌病原體之生物活性之方法，所述方法包括在至少一種佐劑的存在下施用式I化合物：



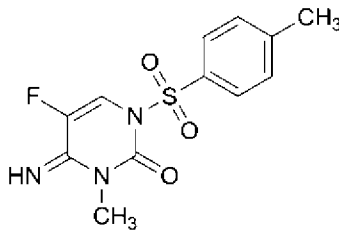
式I

其中佐劑係選自由以下組成之群組：

- (i) 聚氧化烯烷基醚；
- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；
- (iv) 乙烯吡咯啉酮及其衍生物；及
- (v) 糖基界面活性劑

從而改良所述式I化合物之生物活性。

【0020】 本發明亦提供一種用於增加液體組合物之穩定性之方法，所述液體組合物包括式I化合物：

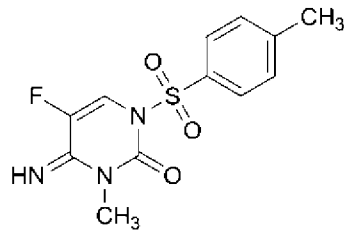


式I

；

及液體載體，其中所述方法包括選擇液體載體，其中式I化合物在液體載體中之溶解度小於5000 ppm。在一些實施例中，式I化合物在液體載體中之溶解度小於1000 ppm。

【0021】 本發明亦提供一種用於增加液體組合物之穩定性之方法，所述液體組合物包括式I化合物：

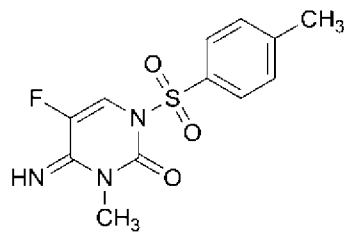


式I

；

及液體載體，其中所述方法包括將組合物之pH值維持在5至7.5之範圍內。

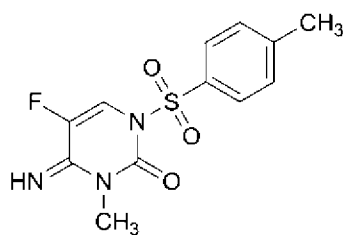
【0022】 本發明亦提供一種pH調節劑之用途，其用於增加包括式I化合物之水性懸浮液濃縮物(suspension concentrate；SC)組合物之穩定性：



式I

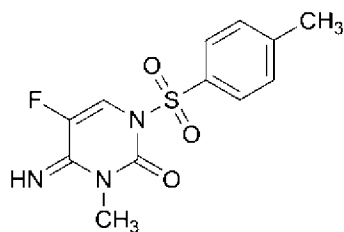
。

【0023】 本發明亦提供一種pH調節劑之用途，其用於增加包括式I化合物之水性懸乳劑(suspoemulsion；SE)組合物之穩定性：



式I

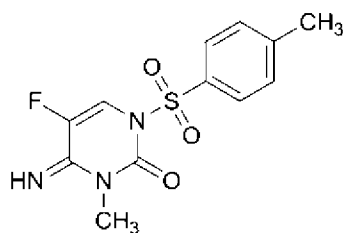
【0024】 本發明亦提供一種用於增加非水性液體組合物之穩定性之方法，所述非水性液體組合物包括式I化合物：



式I

及液體載體，其中按組合物之總重量計，所述方法包括將組合物之含水量維持至小於0.5重量%。

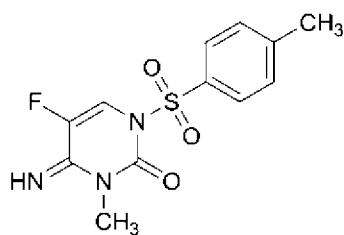
【0025】 本發明亦提供一種用於增加非水性液體組合物之穩定性之方法，所述非水性液體組合物包括式I化合物：



式I

及液體載體，其中按組合物之總重量計，所述方法包括將組合物之含水量維持至小於0.2重量%。

【0026】 本發明亦提供一種用於增加液體組合物之穩定性之方法，所述液體組合物包括式I化合物：

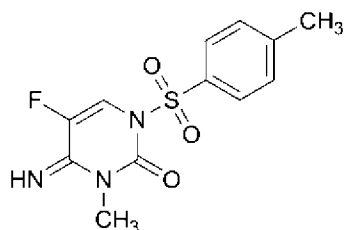


式I

;

及液體載體，其中所述方法包括添加(i)對於液體組合物具有晶體成長抑制特性之至少一種穩定化界面活性劑，或(ii)對於液體組合物具有晶體成長抑制特性之穩定化系統。

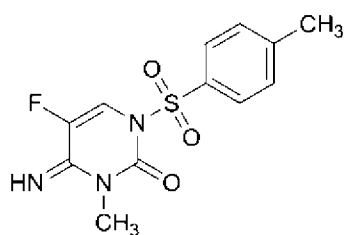
【0027】 本發明亦提供一種具有聚氧化烯聚芳基醚之結構之至少一種穩定化界面活性劑之用途，其用於控制式I化合物之溶解度及/或降解：



式I

。

【0028】 本發明亦提供一種用於增加液體組合物之穩定性之方法，所述液體組合物包括式I化合物：



式I

;

及液體載體，其中所述方法包括將組合物調配為具有至少500 cP之黏度。

【0029】 本發明提供一種用於製備本文所揭示之懸浮液濃縮物 (suspension concentrate ; SC)組合物之方法，所述方法包括以下步驟：

(1) 將農業上可接受之惰性添加劑與水性液體載體混合，得到預混合物；

(2) 向步驟(1)中獲得之預混合物中添加式I化合物，得到混合物；及

(3) 研磨步驟(2)所得混合物，得到所需組合物。

【0030】 在一些實施例中，所述方法包括在研磨混合物之前向步驟(2)之混合物中添加額外添加劑。

【0031】 本發明提供一種用於製備本文所揭示之懸乳劑(SE)組合物之方法，所述方法包括以下步驟：

(1) 將農業上可接受之惰性添加劑與水性液體載體混合，得到預混合物；

(2) 向步驟(1)中獲得之所述預混合物中添加所述式I化合物及至少一種佐劑，得到一混合物；及

(3) 研磨步驟(2)所得混合物，得到所需組合物。

【0032】 本發明提供一種用於製備本文所揭示之油分散液(oil dispersion；OD)組合物之方法，所述方法包括以下步驟：

(1) 將農業上可接受之惰性添加劑與非水性液體載體混合，得到預混合物；

(2) 向步驟(1)中獲得之預混合物中添加式I化合物，得到混合物；及

(3) 研磨步驟(2)所得混合物，得到所需組合物。

【0033】 本發明提供一種用於製備本文所揭示之可乳化濃縮物(emulsifiable concentrate；EC)組合物之方法，所述方法包括以下步驟：

(1) 將農業上可接受之惰性添加劑與非水性液體載體混合，得到預混合物；

- (2) 向步驟(1)中獲得之預混合物中添加式I化合物，得到混合物；及
- (3) 過濾步驟(2)之溶液，得到所需組合物。

【圖式簡單說明】

【0034】

圖1.低Trycol®(係指0.2 L/ha)、Trycol®(係指0.4 L/ha)或Silwett作為佐劑對於式I化合物之活性之效果。將自小麥植物栽培種Alixan之對DMI殺真菌劑具有中等抗性及對QoI殺真菌劑具有高度抗性之小麥葉枯病菌菌株Mg Tri-R6之21天感染後(days post infection ; dpi)所量測之感染強度測定的疾病進展曲線下的面積(Area Under Disease Progress Curve ; AUDPC)進行比較，所述栽培種未處理，或以2個速率(0.028及0.014 L/ha)用式I化合物450懸浮液濃縮物組合物單獨(無佐劑)或與呈槽式混合物之佐劑一起處理。根據Newman及Keuls測試，在相同觀測時序之後加上相同字母之值無顯著差異($p < 0.05$)。

圖2.低Trycol®(係指0.2 L/ha)、Trycol®(係指0.4 L/ha)或Silwett佐劑對於式I化合物之活性之效果。將獲自式I化合物450懸浮液濃縮物組合物之AUDPC值之殺真菌劑功效進行比較，在受控條件下，所述組合物以2個速率(0.028及0.014 L/ha)單獨(無佐劑)使用或以1個速率與佐劑(低Trycol®、Trycol®或Silwett®)一起使用，以針對對DMI具有中等抗性及對QoI殺真菌劑具有高度抗性之小麥葉枯病菌菌株Mg Tri-R6。

圖3.作為內置式組合物之兩種佐劑PVP與AGNIQUE BP420之組合對於式I化合物之活性之效果。將自小麥植物栽培種Alixan之對DMI殺真菌劑具有中等抗性及對QoI殺真菌劑具有高度抗性之小麥葉枯病菌菌株Mg Tri-R6之21 dpi所量測之感染強度測定的疾病進展曲線下的面積(AUDPC)

進行比較，所述栽培種未處理，或與10 g a.i./ha之速率用式I化合物450懸浮液濃縮物組合物單獨(無佐劑)或與佐劑一起處理。根據Newman及Keuls測試，在相同觀測時序之後加上相同字母之值無顯著差異($p < 0.05$)。

圖4.作為內置式組合物之兩種佐劑PVP與AGNIQUE® BP420之組合對於式I化合物之活性之效果。將獲自式I化合物之懸浮液濃縮物組合物之AUDPC值之殺真菌劑功效進行比較，在受控條件下，所述組合物以10 g a.i./ha使用，以針對對DMI具有中等抗性及對QoI殺真菌劑具有高度抗性之小麥葉枯病菌菌株Mg Tri-R6。

圖5.作為內置式組合物(450懸浮液濃縮物組合物)之以下三個佐劑組合對於式I化合物之活性之效果：PVP與AGNIQUE® BP420之組合；VP/VA與Silwett之組合；及VP/VA與AGNIQUE® BP420之組合。對於小麥小植株栽培種Alixan之第一葉片之疾病評定(感染強度)，所述栽培種未處理，或在受控條件下接種對DMI具有中等抗性及對QoI殺真菌劑具有高度抗性之小麥葉枯病菌菌株Mg Tri-R6之孢子21天後，以10 g a.i./ha用式I化合物之懸浮液濃縮物組合物處理。根據Newman及Keuls測試，在相同觀測時序之後加上相同字母之值無顯著差異($p < 0.05$)。

圖6.作為內置式組合物(450懸浮液濃縮物組合物)之以下三個佐劑組合對於式I化合物式I化合物之活性之效果：PVP與AGNIQUE® BP420之組合；VP/VA與Silwett®之組合；及VP/VA與AGNIQUE® BP420之組合。殺真菌劑功效獲自式I化合物之懸浮液濃縮物組合物之21 dpi所測定之感染強度，在受控條件下，所述組合物以10 g a.i./ha使用，以針對對DMI具有中等抗性及對QoI殺真菌劑具有高度抗性之小麥葉枯病菌菌株Mg Tri-R6。

圖7.將自小麥植物栽培種Alixan之對DMI殺真菌劑具有中等抗性及對QoI殺真菌劑具有高度抗性之小麥葉枯病菌菌株Mg Tri-R6之21 dpi及28 dpi所量測之感染強度測定的疾病進展曲線下的面積(AUDPC)進行比較，所述栽培種未處理，或以2個速率(0.25及0.125 L/ha)用式I化合物50可乳化濃縮物組合物A單獨(無佐劑/添加劑)或與佐劑(Trycol®)一起處理，及用組合物B單獨(無佐劑/添加劑)或與佐劑(低Trycol®、Trycol®、Synergen® SOC)一起處理。根據Newman及Keuls測試，在相同時序觀測後加上相同字母之值無顯著差異($p < 0.05$)。

圖8.將獲自式I化合物50可乳化濃縮物組合物之AUDPC值之殺真菌劑功效進行比較，在受控條件下，所述組合物以2個速率(0.25及0.125 L/ha)組合物A單獨(無佐劑)或與佐劑(Trycol®)一起使用，及組合物B單獨(無佐劑/添加劑)或與佐劑(低Trycol®、Trycol®、Synergen® SOC)一起使用，以針對對DMI具有中等抗性及對QoI殺真菌劑具有高度抗性之小麥葉枯病菌菌株Mg Tri-R6。

圖9.對於小麥小植株栽培種Alixan之第一葉片之疾病評定(感染強度)，所述栽培種未處理，或在受控條件下接種對DMI具有中等抗性及對QoI殺真菌劑具有高度抗性之小麥葉枯病菌菌株Mg Tri-R6之孢子21天後，以10 g a.i./ha及20 g a.i./ha用式I化合物原型A之OD調配物處理。

圖10.對於馬鈴薯晚疫病(致病疫黴(*Phytophthora infestans*))之疾病評定(感染%)。在每週六次施用之後進行田間試驗評定。

【實施方式】

【0035】本申請主張2018年11月5日申請之美國臨時申請案第62/755,866號之權利，該申請案之全文在此以引用之方式併入本文中。

【0036】 在本申請通篇中參考各種公開案。此等文獻之揭示內容在此以其全文引用之方式併入本申請中，以便更充分地描述本發明所涉及之目前先進技術。

定義

【0037】 除非另外定義，否則本文所用之所有技術及科學術語均具有與本主題所屬領域之一般熟習此項技術者通常所理解之含義。

【0038】 除非另外特定陳述，否則如本文所用，術語「一(a/an)」包括單數及複數。因此，術語「一(a/an)」或「至少一個(種)」在本申請中可互換地使用。

【0039】 如本文所用，當與數值結合使用時，術語「約」包含所指示值之 $\pm 10\%$ 。另外，針對本文中之相同組分或特性之所有範圍的端點包含端點，可獨立組合，且包含所有中間點及範圍。應理解，當提供參數範圍時，本發明亦提供在彼範圍內之所有整數及其十分之一。舉例而言，「0.1%-80%」包含0.1%、0.2%、0.3%等，直至80%。

【0040】 如本文所用，術語「植物」或「作物」包含指代完整的植物、植物器官(例如葉片、莖幹、嫩枝、根、幹、分枝、芽、果實等)、植物細胞或植物種子。此術語亦涵蓋植物作物，諸如果實。在又一實施例中，術語「植物」可包含：其繁殖材料，其可包含植物之所有生殖部分，諸如種子；及營養植物材料，諸如插條及塊莖，其可用於植物增殖。此包含種子、塊莖、孢子、球莖、鱗莖、根莖、新枝基底芽、匍匐莖及蓓蕾及植物之其他部分，包含待在發芽之後或自土壤中出苗之後移植的幼苗及幼齡植物。

【0041】 如本文所用，術語「部位(locus)」不僅包含待控制感染之

區域，且亦包含待預防感染之區域以及在栽培下之區域。

【0042】 如本文所用，術語「混合物」或「組合」係指(但不限於)任何物理形式之組合，例如摻合物、溶液、摻雜物(alloy)或類似者。

【0043】 如本文所用，術語「有效量」係指當施用時化合物足以達成良好控制水準之量。

【0044】 如本文所用，片語「農業化學上可接受」意謂其為本領域中已知且可接受用於農業/農藥用途。

【0045】 如本文所用，術語「佐劑」廣義地定義為自身不為殺真菌劑但增強或預期增強與其一起使用之殺真菌劑之效果的任何物質。佐劑可理解為包含(但不限於)擴散劑、滲透劑、相容劑及防漂移劑。如本文所用，術語「添加劑」定義為自身不為殺真菌劑但添加至組合物中之任何物質，諸如黏著劑、界面活性劑、增效劑、緩衝劑、酸化劑、消泡劑及增稠劑。

【0046】 如本文所用，術語「內置式(built-in)」意謂所有組分，諸如農藥、佐劑及其他添加劑，係在同一組合物中。

【0047】 如本文所用，術語「槽式混合物(tank mix)」意謂，在施用之前或在噴霧施用時，將至少一種農藥及/或添加劑及/或佐劑混合在噴霧槽中。

【0048】 如本文所用，片語「農業上可接受之載體」意謂本領域中已知且可接受用於形成用於農業或園藝用途之組合物之載體。

【0049】 如本文所用，術語「增稠劑」係指增加液體組合物之黏度而基本上不改變組合物之其他特性之藥劑。

【0050】 如本文所用，術語「穩定」係指化學穩定性、物理穩定性

或兩者。

【0051】如本文所用，術語「穩定」當用結合化學穩定性使用(例如化學穩定的)時意謂，組合物滿足聯合國糧食與農業組織(Food and Agriculture Organization of the United Nations ; FAO)在《FAO發展及使用手冊(Manual on Development and Use of FAO)》及《WHO農藥規範(WHO Specification for Pesticides)》(第一版-第三次校正)(「FAO/WHO手冊(FAO/WHO Manual)」)(可在 <http://www.fao.org/agriculture/crops/thematic-sitemap/theme/pests/jmps/manual/en/>獲得)中闡述之化學穩定性標準，其全部內容在此以引用之方式併入本申請中。如FAO/WHO手冊中所描述，若在 $54 \pm 2^{\circ}\text{C}$ 之溫度下儲存14天之後，在 $50 \pm 2^{\circ}\text{C}$ 之溫度下儲存4週之後，在 $45 \pm 2^{\circ}\text{C}$ 之溫度下儲存6週之後，在 $40 \pm 2^{\circ}\text{C}$ 之溫度下儲存8週之後，在 $35 \pm 2^{\circ}\text{C}$ 之溫度下儲存12週之後，或在 $30 \pm 2^{\circ}\text{C}$ 之溫度下儲存18週之後，未觀測到組合物中之活性成分之顯著降解，則組合物為穩定的。在降解視為顯著之前所允許之降解量視組合物中之活性成分之濃度而定。如FAO/WHO手冊中所描述，對於包括高於25至100 g/L活性成分之組合物，至多10%之活性成分降解視為無顯著降解；對於包括高於100至250 g/L活性成分之組合物，至多6%之活性成分降解視為無顯著降解；對於包括高於250至500 g/L活性成分之組合物，至多5%之活性成分降解視為無顯著降解；及對於包括高於500 g/L活性成分之組合物，至多25 g/L之活性成分降解視為無顯著降解。

【0052】如本文所用，術語「穩定」當結合物理穩定性使用(例如物理穩定的)時及當結合組合物使用時意謂，組合物滿足國際農藥分析合作

委員會(Collaborative International Pesticides Analytical Council ; CIPAC)闡述之物理穩定性標準。CIPAC為促進關於用於分析農藥之方法及用於調配物之物理化學測試方法之國際協議的國際組織。CIPAC所採納之方法公開於CIPAC手冊中，可在<https://www.cipac.org/index.php/methods-publications>在線獲得，每一方法之全部內容在此以引用之方式併入本申請中。

【0053】 如本文所用，術語「穩定化界面活性劑(stabilizing surfactant)」定義為當添加至包括式I化合物之液體組合物中時增加式I化合物之物理及/或化學穩定性之任何界面活性劑。在一些實施例中，穩定化界面活性劑對抑制晶體成長有效。

【0054】 如本文所用，術語「低含水量」當結合界面活性劑或載體使用時意謂，界面活性劑或載體使水以小於25 g/L之量溶解。

【0055】 如本文所用，術語「w/w」意謂按組合物或混合物之總重量計之重量百分比。

【0056】 如本文所用，術語「液體」意謂不為氣體之液體。

【0057】 式I化合物為N3-Me-5-FU之原農藥衍生物，其相應地在位置N1及C4上包括敏感性基團，諸如磺醯基及亞胺。此等「基團」導致高度敏感的不穩定結構，此需要研發用於使式I化合物在液體組合物中穩定的特定條件。另外，式I化合物具有若干晶體形式，且具有形成較少可獲得且影響滲透至目標中之速率之晶體的傾向。

【0058】 包括活性成分之調配組合物通常需要添加農業上可接受之惰性添加劑。諸如界面活性劑、分散劑、乳化劑、潤濕劑、消泡劑、溶劑、共溶劑、光穩定劑、UV吸收劑、自由基清除劑及抗氧化劑、黏著

劑、中和劑、增稠劑、黏合劑、鉗合劑(sequestrates)、殺生物劑、緩衝劑、防腐劑及抗冷凍劑。添加劑之添加影響活性成分之溶解度，且產生化學及物理上不穩定的組合物。

【0059】 可用於式I化合物之溶劑及添加劑應為中性的，亦即無可影響式I化合物之穩定性且引起其降解之活性官能基。用於調配式I化合物之溶劑及/或添加劑不應與式I化合物反應。

【0060】 可影響式I化合物之穩定性之官能基為含有N及/或O之基團，諸如S-O、OH及非空間位阻的醯胺及胺。發現式I化合物在醯胺溶劑中之化學穩定性視醯胺上之取代基而定。溶劑及/或添加劑之反應性在調配包括式I化合物之穩定組合物中為關鍵的。反應性親核基團為諸如以下之基團：鍵解離能量小於120 Kcal/mol之羥基、弱解離氫鍵或酸性官能基。

【0061】 組合物中之水之濃度為化學及/或物理穩定性之另一關鍵因素。

【0062】 由於上述原因，液體在組合物中調配式I化合物尤其具有挑戰性。

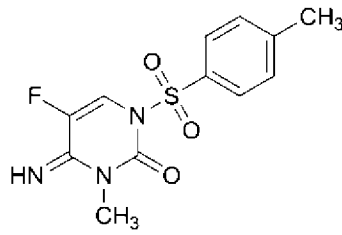
【0063】 發現，液體載體中之式I化合物之穩定性可藉由以下來改良：控制液體載體中之式I化合物之溶解度，控制水環境中之組合物之pH，控制組合物中之含水量，添加對預防晶體生長有效之界面活性劑，及/或控制組合物之黏度。

【0064】 在下文描述包括式I化合物之穩定的液體組合物以及其使用方法與製備方法。

穩定的液體組合物：

【0065】 本發明提供一種穩定的液體組合物，其包括：

(a) 殺真菌有效量之式I化合物：



式I

，及

(b) 液體載體。

【0066】 在一些實施例中，式I化合物在液體載體中之溶解度小於5000 ppm。在一些實施例中，式I化合物在液體載體中之溶解度小於1000 ppm。在一些實施例中，式I化合物在液體載體中之溶解度在50至500 ppm之範圍內。在一些實施例中，式I化合物在液體載體中之溶解度為約200 ppm。在一些實施例中，式I化合物在液體載體中之溶解度為約80 ppm。

【0067】 在一些實施例中，組合物包括至少一種穩定化界面活性劑。在一些實施例中，組合物包括至少兩種穩定化界面活性劑。在一些實施例中，組合物包括兩種穩定化界面活性劑。在一些實施例中，組合物進一步包括穩定化系統。

【0068】 在一些實施例中，組合物包括至少一種陰離子性穩定化界面活性劑。在一些實施例中，組合物包括至少一種非離子性穩定化界面活性劑。在一些實施例中，組合物包括兩種穩定化界面活性劑。在一些實施例中，組合物包括穩定化系統。在一些實施例中，組合物包括非離子性穩定化界面活性劑與離子性穩定化界面活性劑之組合。

【0069】 在一些實施例中，穩定化界面活性劑影響式I化合物在液體載體中之溶解度。

【0070】 在一些實施例中，組合物之pH在5至7.5之範圍內。在一些實施例中，組合物之pH在6至7之範圍內。在一些實施例中，組合物之pH為約5。在一些實施例中，組合物之pH為約5.5。在一些實施例中，組合物之pH為約5.8。在一些實施例中，組合物之pH為約6。在一些實施例中，組合物之pH為約6.5。在一些實施例中，組合物之pH為約7。在一些實施例中，組合物之pH為約7.5。

【0071】 在一些實施例中，當組合物在水存在下時，量測組合物之pH。水可作為液體載體存在於組合物中。水亦可由於稀釋或潤濕存在於組合物中。

【0072】 在一些實施例中，在不進一步稀釋及/或潤濕之情況下，量測組合物之pH。在一些實施例中，在稀釋及/或潤濕之後，量測組合物之pH。

【0073】 在一些實施例中，液體載體為水，且在不進一步稀釋及/或潤濕之情況下量測組合物之pH。在一些實施例中，其中液體載體為非水性載體，且在稀釋及/或潤濕之後量測組合物之pH。

【0074】 在一些實施例中，組合物包括pH調節劑。

【0075】 組合物之化學穩定性受組合物之pH影響。

【0076】 當液體載體為非水性時，組合物中之水之量，按組合物之總重量計，應小於0.5重量%，較佳地，按組合物之總重量計，小於0.2重量%。

【0077】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，非水性組合物具有小於0.5重量%之含水量。在一些實施例中，按組合物之總重量計，非水性組合物具有小於0.4重量%之含水量。在一些實施例中，按組合物之

總重量計，非水性組合物具有小於0.3重量%之含水量。在一些實施例中，按組合物之總重量計，非水性組合物具有小於0.2重量%之含水量。在一些實施例中，按組合物之總重量計，非水性組合物具有小於0.1重量%之含水量。

【0078】 按組合物之總重量計，小於0.5重量%之水量，較佳地按組合物之總重量計，小於0.2重量%，可使用包括(但不限於)以下之方法來達成：在添加組分至組合物中之前乾燥組合物之組分，及/或降低組合物中之組分(活性及非活性組分兩者)之含水量。組合物之含水量亦可藉由使用低含水量界面活性劑、低含水量載體、水清除劑及/或乾燥劑來控制。

【0079】 在一些實施例中，組合物包括低含水量界面活性劑。在一些實施例中，組合物包括低含水量載體。在一些實施例中，組合物包括至少一種水清除劑。在一些實施例中，組合物包括至少一種乾燥劑。在一些實施例中，在將組合物乾燥之後，向組合物中添加低含水量界面活性劑、低含水量載體、水清除劑及/或乾燥劑。

【0080】 在一些實施例中，水清除劑係選自由以下組成之群組：正矽酸四乙酯、Dynasylan®及其組合。在一些實施例中，Dynasylan®為Dynasylan® P。此等水清除劑將非水性液體組合物之含水量降低至低於0.5重量%，此改良組合物之穩定性。此等水清除劑將OD組合物之含水量降低至低於0.5重量%，此改良組合物之穩定性。此等水清除劑將EC組合物之含水量降低至低於0.5重量%，此改良組合物之穩定性。

【0081】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物中之水清除劑之量係在約0.5重量%與7.5重量%之間。

【0082】 在一些實施例中，組合物具有至少500 cP之黏度。在一些

實施例中，組合物具有500 cP - 3000 cP之黏度。在一些實施例中，組合物具有500 cP - 2500 cP之黏度。在一些實施例中，組合物具有800 cP - 3000 cP之黏度。在一些實施例中，組合物具有1600 cP - 2200 cP之黏度。在一些實施例中，組合物具有等於或小於3000 cP之黏度。

【0083】 在一些實施例中，組合物具有約500 cP - 1000 cP之黏度。在一些實施例中，組合物具有約1000 cP - 1500 cP之黏度。在一些實施例中，組合物具有約1500 cP - 2000 cP之黏度。在一些實施例中，組合物具有約2000 cP - 2500 cP之黏度。在一些實施例中，組合物具有約2500 cP - 3000 cP之黏度。

【0084】 在一些實施例中，組合物具有以下之黏度：約500 cP、約600 cP、約700 cP、約800 cP、約900 cP、約1000 cP、約1100 cP、約1200 cP、約1300 cP、約1400 cP、約1500 cP、約1600 cP、約1700 cP、約1800 cP、約1900 cP about 2000 cP, about 2100 cP、約2200 cP、約2300 cP、約2400 cP about 2500 cP、約2600 cP、約2700 cP、約2800 cP、約2900 cP、約3000 cP。

【0085】 在一些實施例中，液體載體為水性液體載體。在一些實施例中，水性液體載體為水。

【0086】 在一些實施例中，液體載體為非水性液體載體。

【0087】 在一些實施例中，式I化合物在水性液體載體中之溶解度小於5000 ppm。在一些實施例中，式I化合物在非水性載體中之溶解度小於5000 ppm。

【0088】 在一些實施例中，式I化合物呈固體顆粒形式。在一些實施例中，將式I化合物之固體顆粒懸浮於水性載體中。在一些實施例中，將

式I化合物所述固體顆粒懸浮於非水性載體中。

【0089】 在一些實施例中，將式I化合物溶解於非水性載體中。

【0090】 當將式I化合物之固體顆粒懸浮於水性載體中時，組合物為懸浮液濃縮物(SC)。

【0091】 當包括水性載體之SC組合物進一步包括非水性液體組分時，SC組合物為懸乳劑(SE)。當將式I化合物之固體顆粒懸浮於水性載體中且組合物進一步包括非水性液體組分時，組合物為懸乳劑(SE)。非水性液體組分可為(但不限於)佐劑、佐劑之載體及/或任何添加劑。在一些實施例中，非水性液體組分為佐劑。當SC組合物在水性載體中進一步包括非水性液體組分時，SC組合物為SE組合物。

【0092】 當將式I化合物之固體顆粒懸浮於非水性載體中時，組合物為油分散液(OD)。

【0093】 當將式I化合物溶解於非水性載體中時，組合物為可乳化濃縮物(EC)。

【0094】 在一些實施例中，穩定的液體組合物為懸浮液濃縮物(SC)組合物。在一些實施例中，組合物為懸乳劑(SE)組合物。在一些實施例中，組合物為油分散液(OD)組合物。在一些實施例中，組合物為可乳化濃縮物(EC)組合物。

【0095】 在一些實施例中，穩定的液體組合物為包括至少一種穩定化界面活性劑之懸浮液濃縮物(SC)組合物。在一些實施例中，穩定的液體組合物為包括兩種穩定化界面活性劑之懸浮液濃縮物(SC)組合物。

【0096】 在一些實施例中，穩定的液體組合物為包括至少一種穩定化界面活性劑之懸乳劑(SE)組合物。在一些實施例中，穩定的液體組合物

為包括兩種穩定化界面活性劑之懸乳劑(SE)組合物。

【0097】 在一些實施例中，穩定的液體組合物為pH在5至7.5之範圍內之懸浮液濃縮物(SC)組合物。

【0098】 在一些實施例中，穩定的液體組合物為pH在5至7.5之範圍內之懸乳劑(SE)組合物。

【0099】 在一些實施例中，穩定液體組合物為油分散液(OD)組合物，其中按組合物之總重量計，其含水量小於0.5重量%。

【0100】 在一些實施例中，穩定的液體組合物為可乳化濃縮物(EC)組合物，其中按組合物之總重量計，其含水量小於0.5重量%。

【0101】 在一些實施例中，組合物包括水性載體，且水性組合物具有至少500 cP之黏度。在一些實施例中，組合物包括水性載體，且水性組合物具有等於或小於3000 cP之黏度。

【0102】 在一些實施例中，穩定的液體組合物為懸浮液濃縮物(SC)組合物，且SC組合物具有至少500 cP之黏度。在一些實施例中，穩定的液體組合物為懸浮液濃縮物(SC)組合物，且SC組合物具有800 cP - 3000 cP之黏度。在一些實施例中，穩定的液體組合物為懸浮液濃縮物(SC)組合物，且SC組合物具有1600 cP - 2200 cP之黏度。在一些實施例中，穩定的液體組合物為懸浮液濃縮物(SC)組合物，且SC組合物具有等於或小於3000 cP之黏度。

【0103】 在一些實施例中，組合物包括非水性液體載體，且非水性組合物具有至少500 cP之黏度。在一些實施例中，組合物包括非水性液體載體，且非水性組合物具有等於或小於3000 cP之黏度。

【0104】 在一些實施例中，穩定的液體組合物為油分散液(OD)組合

物，且OD組合物具有至少500 cP之黏度。在一些實施例中，穩定的液體組合物為油分散液(OD)組合物，且OD組合物具有500 cP - 2500 cP之黏度。在一些實施例中，穩定的液體組合物為油分散液(OD)組合物，且OD組合物具有等於或小於2500 cP之黏度。

【0105】 黏度可使用國際農藥分析合作委員會(CIPAC)MT192-《藉由旋轉黏度計進行液體黏度量測(viscosity of liquids by rotational viscometer)》來量測，其全部內容在此以引用之方式併入本申請中。當在本申請中描述黏度時，使用CIPAC MT192，使用軸(spindle)62以12 rpm或軸63以12 rpm來量測黏度。

【0106】 在一些實施例中，使用軸62以12 rpm來量測黏度。在一些實施例中，使用軸63以12 rpm來量測黏度。在一些實施例中，當使用CIPAC MT192，使用軸62以12 rpm或使用軸63以12 rpm來量測時，組合物具有至少500 cP之黏度。在一些實施例中，當使用CIPAC MT192，使用軸62以12 rpm或使用軸63以12 rpm來量測時，組合物具有500 cP - 3000 cP之黏度。在一些實施例中，當使用CIPAC MT192，使用軸62以12 rpm或使用軸63以12 rpm來量測時，組合物具有500 cP - 2500 cP之黏度。在一些實施例中，當使用CIPAC MT192，使用軸62以12 rpm或使用軸63以12 rpm來量測時，組合物具有800 cP - 3000 cP之黏度。在一些實施例中，當使用CIPAC MT192，使用軸62以12 rpm或使用軸63以12 rpm來量測時，組合物具有1600 cP - 2200 cP之黏度。在一些實施例中，當使用CIPAC MT192，使用軸62以12 rpm或使用軸63以12 rpm來量測時，組合物具有等於或小於3000 cP之黏度。

【0107】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物中之水性

載體之總量在約30重量%至約70重量%之範圍內。在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物中之水性載體之總量在約40重量%至約60重量%之範圍內。在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物中之水性載體之總量在約40重量%至約50重量%之範圍內。

【0108】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，SC組合物中之水性載體之總量在約30重量%至約70重量%之範圍內。在一些實施例中，按組合物之總重量計，SC組合物中之水性載體之總量在約40重量%至約60重量%之範圍內。在一些實施例中，按組合物之總重量計，SC組合物中之水性載體之總量在約40重量%至約50重量%之範圍內。

【0109】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，SE組合物中之水性載體之總量在約30重量%至約70重量%之範圍內。在一些實施例中，按組合物之總重量計，SE組合物中之水性載體之總量在約40重量%至約60重量%之範圍內。在一些實施例中，按組合物之總重量計，SE組合物中之水性載體之總量在約40重量%至約50重量%之範圍內。

【0110】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物中之非水性載體之總量在約30重量%至約80重量%之範圍內。在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物中之非水性載體之總量在約40重量%至約70重量%之範圍內。在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物中之非水性載體之總量為約50重量%。

【0111】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，OD組合物中之非水性載體之總量在約30重量%至約80重量%之範圍內。在一些實施例中，按組合物之總重量計，OD組合物中之非水性載體之總量在約40重量%至約70重量%之範圍內。在一些實施例中，按組合物之總重量計，OD組合

物中之非水性載體之總量為約50重量%。

【0112】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，EC組合物中之非水性載體之總量在約30重量%至約80重量%之範圍內。在一些實施例中，按組合物之總重量計，EC組合物中之非水性載體之總量在約40重量%至約70重量%之範圍內。在一些實施例中，按組合物之總重量計，EC組合物中之非水性載體之總量在約40重量%至約80重量%之範圍內。在一些實施例中，按組合物之總重量計，EC組合物中之非水性載體之總量為約80重量%。

【0113】 在一些實施例中，穩定的液體組合物中之式I化合物之濃度為150 g/L至750 g/L。在一些實施例中，穩定的液體組合物中之式I化合物之濃度為300 g/L至750 g/L。在一些實施例中，穩定的液體組合物中之式I化合物之濃度為450 g/L。在一些實施例中，穩定的液體組合物中之式I化合物之濃度為660 g/L。

【0114】 在一些實施例中，按穩定的組合物之總重量計，組合物中之式I化合物之濃度大於5重量%。在一些實施例中，按穩定的組合物之總重量計，組合物中之式I化合物之濃度大於10重量%。在一些實施例中，按穩定的組合物之總重量計，組合物中之式I化合物之濃度大於25重量%。在一些實施例中，按穩定的液體組合物之總重量計，組合物中之式I化合物之濃度大於50重量%。

【0115】 在一些實施例中，按穩定的組合物之總重量計，SC組合物中之式I化合物之濃度大於25重量%。在一些實施例中，按穩定的液體組合物之總重量計，SC組合物中之式I化合物之濃度大於50重量%。

【0116】 在一些實施例中，按穩定的組合物之總重量計，SE組合物

中之式I化合物之濃度大於25重量%。在一些實施例中，按穩定的液體組合物之總重量計，SE組合物中之式I化合物之濃度大於50重量%。

【0117】 在一些實施例中，按穩定的組合物之總重量計，OD組合物中之式I化合物之濃度大於25重量%。在一些實施例中，按穩定的液體組合物之總重量計，OD組合物中之式I化合物之濃度大於50重量%。

【0118】 在一些實施例中，按穩定的液體組合物之總重量計，EC組合物中之式I化合物之濃度大於5重量%。在一些實施例中，按穩定的液體組合物之總重量計，EC組合物中之式I化合物之濃度大於10重量%。在一些實施例中，按穩定的液體組合物之總重量計，EC組合物中之式I化合物之濃度大於25重量%。

【0119】 在一些實施例中，包括非水性載體之組合物不含磷酸。在一些實施例中，組合物不含2%或5%之磷酸。在一些實施例中，組合物包括2重量%或更少之磷酸。在一些實施例中，組合物包括5重量%或更少之磷酸。

【0120】 在一些實施例中，包括非水性載體之組合物不含脲。在一些實施例中，組合物不含1%或2%之脲。在一些實施例中，組合物包括1重量%或更少之脲。在一些實施例中，組合物包括2重量%或更少之脲。

【0121】 在一些實施例中，包括非水性載體之組合物不含沒食子酸丙酯。

【0122】 在一些實施例中，包括非水性載體之組合物不含二甲亞砜(dimethyl sulfoxide ; DMSO)。

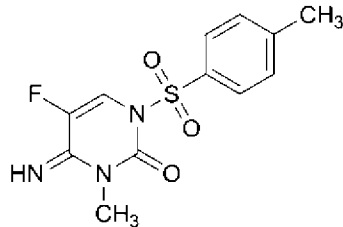
【0123】 在一些實施例中，包括非水性載體之組合物不含嗎啉。

【0124】 在一些實施例中，包括非水性載體之組合物不含N-甲基吡

咯啉酮。

【0125】 本發明提供一種穩定的懸浮液濃縮物(SC)組合物，其包括：

(a) 殺真菌有效量之式I化合物：



式I

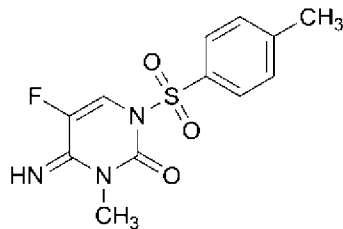
(b) 水性液體載體，及

(c) 至少一種穩定化界面活性劑，

其中組合物具有在5至7.5之範圍內之pH。

【0126】 本發明提供一種懸乳劑(SE)組合物，其包括：

(a) 殺真菌有效量之式I化合物：



式I

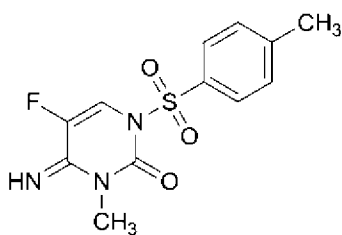
(b) 水性液體載體，及

(c) 至少一種穩定化界面活性劑，

其中組合物具有在5至7.5之範圍內之pH。

【0127】 本發明提供油分散液(OD)組合物，其包括：

(a) 殺真菌有效量之式I化合物：



式I

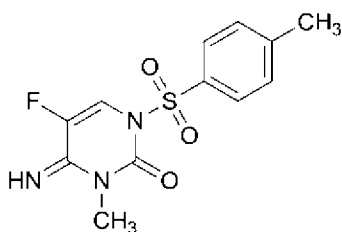
(b) 非水性液體載體，及

(c) 至少一種穩定化界面活性劑，

其中按組合物之總重量計，組合物中之含水量小於0.5重量%，及/或組合物之黏度為至少500 cP。

【0128】 本發明提供一種可乳化濃縮物(EC)組合物，其包括：

(a) 殺真菌有效量之式I化合物：



式I

(b) 非水性液體載體，及

(c) 至少一種穩定化界面活性劑，

其中按組合物之總重量計，組合物中之含水量小於0.5重量%。

【0129】 在一些實施例中，非水性液體載體用作佐劑。

(i) 式I化合物

【0130】 本發明之式I化合物係指任何固體形式，包含(但不限於)非晶形、結晶狀、溶劑合物或水合物。

【0131】 式I化合物包含式I化合物之結晶形式。

【0132】 在一些實施例中，結晶形式為無水結晶形式。在一些實施

例中，無水結晶形式為多晶型物。在一些實施例中，無水結晶形式為假多晶型物。

【0133】 式I化合物之多晶形物描述於PCT國際申請公開案第WO/2019/038583號(2019年2月28日公開)中，其全部內容在此以引用之方式併入本申請中。

【0134】 在一些實施例中，結晶形式為水合物。

【0135】 在一些實施例中，結晶形式為溶劑合物。在一些實施例中，溶劑合物含有1,4-二噁烷。在一些實施例中，溶劑合物含有四氫呋喃。在一些實施例中，溶劑合物含有乙酸乙酯。

【0136】 在一些實施例中，結晶多晶形式(形式I)呈現在以下之 2θ 角處具有特徵峰之X射線粉末繞射圖：9.08、10.98、14.05、17.51、18.75、21.63、23.33、24.70、24.83、25.37、26.51及29.23。在一個實施例中，形式I之粉末X射線繞射圖包括在以下之 2θ 角處之特徵峰：14.05、17.51、18.75、21.63及26.51。在一個實施例中，形式I之粉末X射線繞射圖包括在以下之 2θ 角處之特徵峰：14.05、17.51、18.75及21.63。

【0137】 在一些實施例中，結晶多晶形式(形式I)之特徵在於在大於 210°C 之溫度下開始分解。

【0138】 在一些實施例中，結晶多晶形式(形式I)呈現特徵在於以下之差示掃描熱量測定(Differential Scanning Calorimetry；DSC)熱分析圖：峰值溫度為約 160°C 之主導吸熱峰、起始溫度為約 159°C 之主導吸熱峰及熔融焓為約 110 J/g 之主導吸熱峰。

【0139】 在一個實施例中，結晶多晶形式(形式II)呈現在以下之 2θ 角

處具有特徵峰之X射線粉末繞射圖：7.98、9.20、9.96、11.88、15.99、18.49、21.23、22.33、22.59、26.73。在一個實施例中，形式II之粉末X射線繞射圖包括在以下之 2θ 角處之特徵峰：9.20、9.96、11.88、22.33及22.59。在一個實施例中，形式II之粉末X射線繞射圖包括在以下之 2θ 角處之特徵峰：9.20、11.88、22.33及22.59。

【0140】 在一個實施例中，結晶多晶形式(形式II)呈現TG-FTIR熱分析圖，其特徵在於在大於 210°C 之溫度下開始分解。

【0141】 在一個實施例中，結晶多晶形式(形式II)呈現特徵在於以下之差示掃描熱量測定(DSC)熱分析圖：峰值溫度為約 157°C 之主導吸熱峰、起始溫度為約 156°C 之主導吸熱峰及熔融焓為約 112 J/g 之主導吸熱峰。

【0142】 在一個實施例中，結晶水合物形式(水合物)呈現在以下之 2θ 處具有特徵峰之X射線粉末繞射圖：5.34、7.48、10.68、16.05、21.79、22.99、23.19、24.95、26.95、27.63。在一個實施例中，水合物之粉末X射線繞射圖包括在以下之 2θ 角處之特徵峰：5.34、7.48、10.68、16.05及21.79。在一個實施例中，水合物之粉末X射線繞射圖包括在以下之 2θ 角處之特徵峰：5.34、7.48、10.68及16.05。

【0143】 在一個實施例中，結晶水合物形式(水合物)呈現TG-FTIR熱分析圖，其特徵在於在大於 190°C 之溫度下開始分解。

【0144】 在一個實施例中，結晶水合物形式(水合物)呈現特徵在於以下之差示掃描熱量測定(DSC)熱分析圖：峰值溫度為約 139.5°C 之主導吸熱峰、起始溫度為約 139°C 之主導吸熱峰及熔融焓為約 115 J/g 之主導吸熱峰，其中在密封盤中量測DSC。

【0145】 在一個實施例中，結晶水合物形式(水合物)呈現特徵在於以下之差示掃描熱量測定(DSC)熱分析圖：峰值溫度為約160°C之主導吸熱峰、起始溫度為約159°C之主導吸熱峰及熔融焓為約98 J/g之主導吸熱峰，其中在開放盤中量測DSC。

【0146】 在一個實施例中，結晶溶合物形式(形式S5)呈現在以下之2 θ 處具有特徵峰之X射線粉末繞射圖：5.42、7.50、10.06、10.82、12.80、16.91、21.55、23.13、24.83、26.81、27.77。在一個實施例中，形式S5之粉末X射線繞射圖包括在以下之2 θ 角處之特徵峰：5.42、7.50、10.06、10.82及16.91。在一個實施例中，形式S5之粉末X射線繞射圖包括在以下之2 θ 角處之特徵峰：5.42、7.50、10.82及16.91。

【0147】 在一個實施例中，結晶溶合物形式(形式S5)呈現TG-FTIR熱分析圖，其特徵在於在大於180°C之溫度下開始分解。

【0148】 在一個實施例中，結晶溶合物形式(形式S8)呈現在以下之2 θ 處具有特徵峰之如圖13中所示之X射線粉末繞射圖：4.7、5.00、5.38、6.26、9.66、15.93、21.05、23.97、24.69。在一個實施例中，形式S8之粉末X射線繞射圖包括在以下之2 θ 角處之特徵峰：4.7、5.00、5.38、6.26、9.66及23.97。在一個實施例中，形式S8之粉末X射線繞射圖包括在以下之2 θ 角處之特徵峰：4.7、5.00、9.66及23.97。

【0149】 在一個實施例中，結晶溶合物形式(形式S8)呈現TG-FTIR熱分析圖，其特徵在於在大於180°C之溫度下開始分解。

【0150】 在一個實施例中，結晶溶合物形式(形式S1)呈現在以下之2 θ 處具有特徵峰之X射線粉末繞射圖：5.34、7.48、10.10、10.68、12.90、16.07、21.83、23.09、24.91、26.93。在一個實施例中，形式S1

之粉末X射線繞射圖包括在以下之 2θ 角處之特徵峰：5.34、7.48及10.68。在一個實施例中，形式S1之粉末X射線繞射圖包括在以下之 2θ 角處之特徵峰：5.34、7.48、10.68及21.83。在一個實施例中，形式S1之粉末X射線繞射圖包括在以下之 2θ 角處之特徵峰：5.34、7.48、10.68、16.07及21.83。

【0151】 在一個實施例中，結晶溶合物形式(形式S1)呈現TG-FTIR熱分析圖，其特徵在於在大於 200°C 之溫度下開始分解。

【0152】 在一些實施例中，式I化合物為式I化合物之結晶形式之混合物。

【0153】 在一些實施例中，混合物為一或多種無水結晶形式之混合物。

【0154】 在一些實施例中，混合物為結晶形式I與結晶形式II之混合物。在一些實施例中，混合物為至少25%之結晶形式I。在一些實施例中，混合物為至少50%之結晶形式I。在一些實施例中，混合物為至少75%之結晶形式I。

【0155】 在一些實施例中，混合物為結晶形式I與結晶水合物形式之混合物。在一些實施例中，混合物為至少25%之結晶形式I。在一些實施例中，混合物為至少50%之結晶形式I。在一些實施例中，混合物為至少75%之結晶形式I。

【0156】 在一些實施例中，混合物為結晶形式II與結晶水合物形式之混合物。在一些實施例中，混合物為至少25%之結晶形式II。在一些實施例中，混合物為至少50%之結晶形式II。在一些實施例中，混合物為至少75%之結晶形式II。

【0157】 (ii) 適合的穩定化界面活性劑

【0158】 在一些實施例中，組合物包括至少一種穩定化界面活性劑。在一些實施例中，組合物包括至少兩種穩定化界面活性劑。在一些實施例中，組合物包括穩定化系統。

【0159】 在一些實施例中，組合物包括非離子性穩定化界面活性劑。在一些實施例中，組合物包括陰離子性穩定化界面活性劑。在一些實施例中，組合物包括非離子性穩定化界面活性劑與陰離子性穩定化界面活性劑之組合。

【0160】 在一些實施例中，懸浮液濃縮物(SC)組合物包括至少一種穩定化界面活性劑。在一些實施例中，懸浮液濃縮物(SC)組合物包括至少兩種穩定化界面活性劑。在一些實施例中，懸浮液濃縮物(SC)組合物包括兩種穩定化界面活性劑。

【0161】 在一些實施例中，組合物為懸乳劑(SE)組合物。在一些實施例中，SE組合物包括至少一種穩定化界面活性劑。在一些實施例中，SE組合物包括至少兩種穩定化界面活性劑。在一些實施例中，SE組合物包括兩種穩定化界面活性劑。

【0162】 在一些實施例中，穩定化界面活性劑為物理穩定劑。

【0163】 在一些實施例中，穩定化界面活性劑影響液體載體中之式I化合物之晶體生長速率。在一些實施例中，穩定化界面活性劑降低液體載體中之式I化合物之晶體生長速率。在一些實施例中，穩定化界面活性劑具有晶體生長抑制特性。在一些實施例中，穩定化界面活性劑為晶體生長抑制劑。

【0164】 在一些實施例中，穩定化界面活性劑中之一者為非離子性

穩定化界面活性劑。在一些實施例中，非離子性穩定化界面活性劑係選自由以下組成之群組：聚合物、烷氧基化胺酯(ester alkoxyated amine)、烷氧基化二乙基乙醇胺之酯、聚氧化烯醇醚及醇。

【0165】 在一些實施例中，聚合物為無規聚合物之嵌段聚合物。在一些實施例中，聚合物為三嵌段聚合物。在一些實施例中，三嵌段聚合物為ABA嵌段聚合物。在一些實施例中，聚合物具有低HLB(親水-親脂平衡)值，較佳地HLB值為5。在一些實施例中，聚合物為Atlox™ 4912(Croda製造及銷售)。

【0166】 在一些實施例中，非離子性穩定化界面活性劑為烷氧基化胺酯。在一些實施例中，烷氧基化胺酯為Atlox™ 4915(Croda製造及銷售)。在一些實施例中，非離子性穩定化界面活性劑為Atlox™ 4915(Croda製造及銷售)。在一些實施例中，非離子性穩定化界面活性劑為烷氧基化二乙基乙醇胺。在一些實施例中，非離子性穩定化界面活性劑為二乙基乙醇胺單-三聚酸酯。在一些實施例中，非離子性穩定化界面活性劑為Atlox™ 4915(Croda製造及銷售)。

【0167】 在一些實施例中，聚氧化烯醇醚為脂肪醇醚及/或非脂肪醇醚。

【0168】 在一些實施例中，非離子性穩定化界面活性劑為烷氧基化脂肪醇。

【0169】 在一些實施例中，烷氧基化脂肪醇為Genapol® X080 (Clariant製造及銷售)、Genapol® X 050(Clariant製造及銷售)、十三烷醇聚乙二醇醚、Rhodasurf® LA 30(Solvay製造及銷售)、Aerosol® OT-SE或Aerosol® OT-100(Solvay製造及銷售)、Rhodacal® 70/B (Solvay製造

及銷售)、Arlatone™ TV(Croda製造及銷售)、Alkamuls® A(Solvay製造及銷售)或Alkamuls® BR(Solvay製造及銷售)。

【0170】 在一些實施例中，烷氧基化脂肪醇為Genapol® X080(Clariant製造及銷售)、Genapol® X 050(Clariant製造及銷售)、十三烷醇聚乙二醇醚或Rhodasurf® LA 30(Solvay製造及銷售)。

【0171】 在一些實施例中，烷氧基化脂肪醇為Atlas™ 5002L。

【0172】 在一些實施例中，醇具有C1-C6之短碳鏈。在一些實施例中，醇具有C7-C20之長碳鏈。

【0173】 在一些實施例中，非離子性穩定化界面活性劑為聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物。

【0174】 在一些實施例中，穩定化界面活性劑中之一者為離子性界面活性劑。在一些實施例中，穩定化界面活性劑中之一者為離子性穩定化界面活性劑。

【0175】 在一些實施例中，離子性穩定化界面活性劑係選自由以下組成之群組：Aerosol® OT-SE或Aerosol® OT-100(Solvay製造及銷售)、Rhodacal® 70/B(Solvay製造及銷售)及其組合。

【0176】 在一些實施例中，離子性穩定化界面活性劑為陰離子性穩定化界面活性劑。陰離子性穩定化界面活性劑係指具有陰離子基團之化合物，諸如磷酸鹽及磺酸鹽。可使用之離子性界面活性劑之實例為二辛基磺基丁二酸鈉，其由Solvay製造且以Aerosol® OT-SE銷售。

【0177】 在一些實施例中，陰離子性穩定化界面活性劑為聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物。

【0178】 在一些實施例中，組合物包括至少一種非離子性穩定化界

面活性劑及至少一種陰離子性穩定化界面活性劑。在一些實施例中，穩定化系統包括至少一種非離子性穩定化界面活性劑及至少一種陰離子性穩定化界面活性劑。

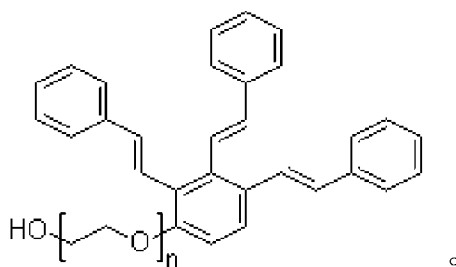
【0179】 在一些實施例中，包括非離子性穩定化界面活性劑及陰離子性穩定化界面活性劑之組合物為SC組合物。在一些實施例中，包括非離子性穩定化界面活性劑及陰離子性穩定化界面活性劑之組合物為SE組合物。

【0180】 在一些實施例中，穩定化界面活性劑中之一者為聚氧化烯聚芳基醚之衍生物。在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚之衍生物為聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物。在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚界面活性劑之衍生物為聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物。

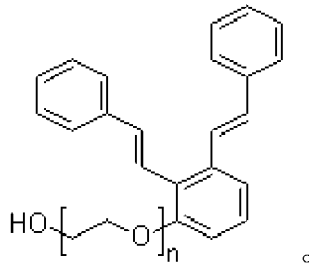
【0181】 在一些實施例中，組合物包括至少兩種穩定化界面活性劑。在一些實施例中，兩種穩定化界面活性劑包括聚氧化烯聚芳基醚之兩種衍生物。在一些實施例中，兩種穩定化界面活性劑包括聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物及聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物。

【0182】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物為芳基經至少兩個芳族基取代之化合物。

【0183】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物具有以下結構：



【0184】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物具有以下結構：



【0185】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物為芳基經至少兩個芳族基取代之化合物。

【0186】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物包括選自以下之群組之陰離子：磷酸根(PO_4)、膦酸根(PO_3)、磺酸根(SO_3)及硫酸根(SO_4)。在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物之陰離子基團具有選自以下之群組之陰離子：磷酸根(PO_4)、膦酸根(PO_3)、磺酸根(SO_3)及硫酸根(SO_4)。

【0187】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚包括選自由以下組成之群組之聚氧化烯基團：聚氧化乙烯基團、聚氧化丙烯、聚氧化丁烯及其任何組合。在一些實施例中，聚氧化烯基團為聚氧化乙烯。在一些實施例中，聚氧化烯基團為聚氧化丙烯。

【0188】 聚氧化烯可包含(但不限於)共聚物及均勻聚合物。共聚物可包含(但不限於)無規聚合物及嵌段聚合物。在一些實施例中，聚氧化烯基團為二嵌段共聚物。在一些實施例中，聚氧化烯基團為三嵌段共聚物。

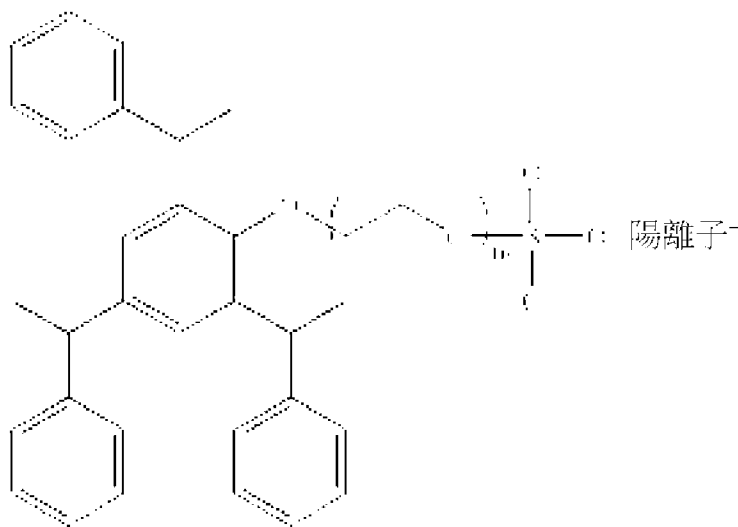
【0189】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚為聚氧化烯苯乙烯基苯基醚。在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚為聚氧化烯苯甲基苯基醚。在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚為聚氧化烯雙苯基醚。在一些實施例

中，聚氧化烯聚芳基醚為聚氧化烯三苯乙基苯基醚。在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚為聚氧化烯二苯乙基苯基醚。在一些實施例中，聚氧化烯二苯乙基苯基醚為聚氧化乙二苯乙基苯基醚。

【0190】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚為陰離子性穩定化界面活性劑。陰離子性穩定化界面活性劑係指具有陰離子基團之化合物，諸如磷酸鹽及磺酸鹽。

【0191】 在一些實施例中，鹽包括陽離子。在一些實施例中，陽離子係選自由以下組成之群組：鈉、鉀、銨、鈣、鎂及其組合。

【0192】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物具有以下結構：



【0193】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物為三苯乙基苯酚乙氧基化物磷酸酯。

【0194】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚為三苯乙基苯酚乙氧基化物磷酸酯。較佳地，三苯乙基苯酚乙氧基化物磷酸酯為由Solvay製造且銷售之Soprophor® 3D33。

【0195】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚為具有54個EO之

2,4,6-三-(1-苯乙基)-苯酚聚乙二醇醚。較佳地，具有54個EO之2,4,6-三-(1-苯乙基)-苯酚聚乙二醇醚為由Clariant製造且銷售之Emulsogen® TS 540。

【0196】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚為乙氧基化三苯乙炔基苯酚。較佳地，乙氧基化三苯乙炔基苯酚為由Solvay製造且銷售之Soprophor® TS/54。

【0197】 在一些實施例中，鹽包括選自由以下組成之群組之至少一種陽離子：鈉、鉀、銨、鈣、鎂及其組合。

【0198】 聚氧化烯聚芳基醚界面活性劑可包含(但不限於)聚苯乙基苯酚及三苯乙炔基苯酚。

【0199】 聚氧化烯聚芳基醚界面活性劑可包含(但不限於)未封端的界面活性劑、封端的界面活性劑或其組合。

【0200】 在一些實施例中，組合物包括穩定化界面活性劑之組合，且穩定化界面活性劑之組合包括非離子性聚氧化烯聚芳基醚界面活性劑與陰離子性聚氧化烯聚芳基醚界面活性劑之混合物。在一些實施例中，非離子性界面活性劑為三苯乙炔基苯酚乙氧基化物。在一些實施例中，陰離子性界面活性劑為三苯乙炔基苯酚乙氧基化物磷酸醚。

【0201】 在一些實施例中，穩定化界面活性劑之組合包括三苯乙炔基苯酚乙氧基化物及三苯乙炔基苯酚乙氧基化物磷酸醚。

【0202】 在一些實施例中，非離子性聚氧化烯聚芳基醚為醚基經至少兩個基團(包括芳環)取代之化合物。

【0203】 在一些實施例中，聚氧化烯基團為聚氧化乙烯。在一些實施例中，聚氧化烯基團為聚氧化丙烯。在一些實施例中，聚氧化烯基團為

聚氧化乙烯之嵌段共聚物。在一些實施例中，聚氧化烯基團為聚氧化丙烯之嵌段共聚物。

【0204】聚氧化烯可包含(但不限於)聚乙氧基化基團、聚丙氧基化基團、聚丁氧基化基團及其任何組合。

【0205】聚氧化烯可包含(但不限於)共聚物及均勻聚合物。

【0206】共聚物可包含(但不限於)無規聚合物及嵌段聚合物。

【0207】在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚為聚氧化烯三苯乙炔基苯基醚。在一些實施例中，聚氧化烯三苯乙炔基苯基醚為聚氧化乙烯三苯乙炔基苯基醚。在一些實施例中，聚氧化烯三苯乙炔基苯基醚為聚氧化乙烯聚氧化丙烯三苯乙炔基苯基醚。

【0208】在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚為聚氧化烯二苯乙炔基苯基醚。在一些實施例中，聚氧化烯二苯乙炔基苯基醚為聚氧化乙烯二苯乙炔基苯基醚。

【0209】在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物為三苯乙炔基苯酚乙氧基化物磷酸酯。

【0210】在一些實施例中，穩定化界面活性劑為三苯乙炔基苯酚-聚乙二醇醚之衍生物。

【0211】在一些實施例中，穩定化界面活性劑為三苯乙炔基苯酚-聚乙二醇醚之陰離子性衍生物。

【0212】在一些實施例中，穩定化界面活性劑為三苯乙炔基苯酚-聚乙二醇醚之非離子性衍生物。

【0213】在一些實施例中，組合物包括兩種穩定化界面活性劑，且兩種穩定化界面活性劑為Soprophor® 3D33及Soprophor® TS/54(TSP

54)。

【0214】 在一些實施例中，組合物包括兩種穩定化界面活性劑，且兩種穩定化界面活性劑均為聚氧化烯聚芳基醚之衍生物。在一些實施例中，組合物包括兩種穩定化界面活性劑，其中一種穩定化界面活性劑為聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物，且一種穩定化界面活性劑為聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物。

【0215】 在一些實施例中，組合物包括至少兩種穩定化界面活性劑，其中至少一種穩定化界面活性劑為聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物，且至少一種穩定化界面活性劑為聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物。

【0216】 在一些實施例中，SC組合物包括兩種穩定化界面活性劑，且兩種穩定化界面活性劑為Soprophor® 3D33及Soprophor® TS/54(TSP 54)。

【0217】 在一些實施例中，SC組合物包括兩種穩定化界面活性劑，且兩種穩定化界面活性劑均為聚氧化烯聚芳基醚之衍生物。在一些實施例中，組合物包括兩種穩定化界面活性劑，其中一種穩定化界面活性劑為聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物，且一種穩定化界面活性劑為聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物。

【0218】 在一些實施例中，SC組合物包括至少兩種穩定化界面活性劑，其中至少一種穩定化界面活性劑為聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物，且至少一種穩定化界面活性劑為聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物。

【0219】 在一些實施例中，SE組合物包括兩種穩定化界面活性劑，

且兩種穩定化界面活性劑為Soprophor® 3D33及Soprophor® TS/54(TSP 54)。

【0220】 在一些實施例中，SE組合物包括兩種穩定化界面活性劑，且兩種穩定化界面活性劑均為聚氧化烯聚芳基醚之衍生物。在一些實施例中，組合物包括兩種穩定化界面活性劑，其中一種穩定化界面活性劑為聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物，且一種穩定化界面活性劑為聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物。

【0221】 在一些實施例中，SE組合物包括至少兩種穩定化界面活性劑，其中至少一種穩定化界面活性劑為聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物，且至少一種穩定化界面活性劑為聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物。

【0222】 在一些實施例中，穩定化界面活性劑為Soprophor® 3D33。

【0223】 在一些實施例中，穩定化界面活性劑為三苯乙炔基苯酚乙氧基化物磷酸酯。

【0224】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚為來自Solvay之Soprophor® 3D 33。

【0225】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚為來自Clariant之Emulsogen® TS 540。

【0226】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚為來自Solvay之Soprophor® TS/54。

【0227】 在一些實施例中，包括陽離子之鹽係選自由以下組成之群組：鈉、鉀、銨、鈣、鎂及其組合。

【0228】聚芳基可指代(但不限於)聚苯乙基苯酚及三苯乙基苯酚。

【0229】聚氧化烯聚芳基醚界面活性劑係指未封端的界面活性劑、封端的界面活性劑或其組合。

【0230】在一些實施例中，界面活性劑之組合包括非離子性聚氧化烯聚芳基醚界面活性劑與陰離子性聚氧化烯聚芳基醚界面活性劑之混合物。在一些實施例中，非離子性界面活性劑為三苯乙基苯酚乙氧基化物。在一些實施例中，陰離子性界面活性劑為三苯乙基苯酚乙氧基化物磷酸醚。

【0231】在一些實施例中，界面活性劑之組合包括三苯乙基苯酚乙氧基化物及三苯乙基苯酚乙氧基化物磷酸醚。

【0232】在一些實施例中，非離子性聚氧化烯聚芳基醚為醚基經至少兩個基團(包括芳環)取代之化合物。

【0233】在一些實施例中，聚氧化烯基團為聚氧化乙烯。在一些實施例中，聚氧化烯基團為聚氧化丙烯。在一些實施例中，聚氧化烯基團為聚氧化乙烯之嵌段共聚物。在一些實施例中，聚氧化烯基團為聚氧化丙烯之嵌段共聚物。

【0234】聚氧化烯可包含(但不限於)聚乙氧基化基團、聚丙氧基化基團、聚丁氧基化基團及其任何組合。

【0235】聚氧化烯可包含(但不限於)共聚物及均勻聚合物。

【0236】共聚物可包含(但不限於)無規聚合物及嵌段聚合物。

【0237】在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚為聚氧化烯三苯乙基苯基醚。在一些實施例中，聚氧化烯三苯乙基苯基醚為聚氧化乙烯三

苯乙烯基苯基醚。在一些實施例中，聚氧化烯三苯乙烯基苯基醚為聚氧化烯聚氧化丙烯三苯乙烯基苯基醚。

【0238】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚為聚氧化烯二苯乙烯基苯基醚。在一些實施例中，聚氧化烯二苯乙烯基苯基醚為聚氧化烯二苯乙烯基苯基醚。

【0239】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物為三苯乙烯基苯酚乙氧基化物磷酸酯。

【0240】 在一些實施例中，穩定化界面活性劑為Emulsogen® TS 540。

【0241】 在一些實施例中，界面活性劑之非離子性衍生物為Emulsogen® TS 540。

【0242】 在一些實施例中，穩定化界面活性劑為Soprophor® TS/54。

【0243】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物為Soprophor® TS/54。

【0244】 在一些實施例中，穩定化界面活性劑為三苯乙烯基苯酚-聚乙二醇醚之陰離子性衍生物。

【0245】 在一些實施例中，穩定化界面活性劑為三苯乙烯基苯酚-聚乙二醇醚之非離子性衍生物。

【0246】 在一些實施例中，組合物包括穩定化系統。

【0247】 在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物與聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物之重量比在0.25:1至1:1之範圍內。在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物與聚氧化烯聚芳基

醚之陰離子性衍生物之重量比在0.25:1至0.5:1之範圍內。在一些實施例中，聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物與聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物之重量為約0.36:1。

【0248】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，穩定的組合物包括至少0.5重量%之聚氧化烯聚芳基醚穩定化界面活性劑。在一些實施例中，按組合物之總重量計，穩定的組合物包括0.5重量%至7重量%之聚氧化烯聚芳基醚穩定化界面活性劑。在一些實施例中，按組合物之總重量計，穩定的組合物包括0.5重量%至15重量%之聚氧化烯聚芳基醚穩定化界面活性劑。在一些實施例中，按組合物之總重量計，穩定的組合物包括0.5重量%至25重量%之聚氧化烯聚芳基醚穩定化界面活性劑。

【0249】 在一些實施例中，式I化合物與聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物之重量比為25:1至10:1。在一些實施例中，式I化合物與聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物之重量比為25:1至10:1。

【0250】 在實施例中，相較於其中式I化合物可溶之液體組合物，穩定化界面活性劑對增加本文中所描述之組合物中之式I化合物之穩定性有效。在一些實施例中，穩定性為化學穩定性。在一些實施例中，穩定性為物理穩定性。

(iii) 適合的pH調節劑

【0251】 在一些實施例中，組合物包括pH調節劑。

【0252】 在一些實施例中，pH調節劑可包含(但不限於)緩衝劑、鹼及/或酸化劑。

【0253】 在一些實施例中，pH調節劑為酸。在一些實施例中，pH調節劑為鹼。

【0254】 在一些實施例中，pH調節劑為至少一種鹼與至少一種酸之混合物。

【0255】 在一些實施例中，pH調節劑為緩衝劑。

【0256】 緩衝劑係指酸與鹼之組合。酸包含(但不限於)有機酸及無機酸。鹼包含(但不限於)有機鹼及無機鹼。

【0257】 有機酸可包含(但不限於)檸檬酸、甲酸、乙酸、丙酸、丁酸、草酸、乳酸、蘋果酸及苯甲酸。

【0258】 無機酸可包含(但不限於)鹽酸、硝酸、磷酸、硫酸及硼酸。

【0259】 有機鹼可包含(但不限於)一級胺及二級胺、吡啶、咪唑及其任何組合。

【0260】 在一些實施例中，pH調節劑為磷酸氫鉀。

【0261】 在一些實施例中，pH調節劑為磷酸一氫二鈉與磷酸氫鉀之組合。

【0262】 在一些實施例中，穩定的液體組合物進一步包括緩衝劑。在一些實施例中，穩定的組合物中之緩衝劑之量為1 g/L至20 g/L。在一些實施例中，穩定的液體組合物進一步包括緩衝劑。在一些實施例中，穩定的組合物中之緩衝劑之量為6 g/L至15 g/L。在一些實施例中，穩定的液體組合物進一步包括緩衝劑。在一些實施例中，穩定的組合物中之緩衝劑之量為7 g/L至10 g/L。在一些實施例中，穩定的組合物中之緩衝劑之濃度為約8.6 g/L。

【0263】 在一些實施例中，緩衝劑為正磷酸二氫鉀。在一些實施例中，穩定的液體組合物中之正磷酸二氫鉀之濃度為1 g/L至5 g/L。在一些

實施例中，穩定的液體組合物中之正磷酸二氫鉀之濃度為1 g/L至3 g/L。在一些實施例中，穩定的液體組合物中之正磷酸二氫鉀之濃度為約1.7 g/L。

【0264】 在一些實施例中，緩衝劑為無水磷酸二鈉。在一些實施例中，穩定的液體組合物中之無水磷酸二鈉之濃度為1 g/L至10 g/L。在一些實施例中，穩定的液體組合物中之無水磷酸二鈉之濃度為5 g/L至10 g/L。在一些實施例中，穩定的液體組合物中之無水磷酸二鈉之濃度為5 g/L至8 g/L。在一些實施例中，穩定的液體組合物中之無水磷酸二鈉之濃度為約6.9 g/L。

(iv) 適合的非水性液體載體

【0265】 在一些實施例中，非水性液體載體包括一種有機溶劑。

【0266】 在一些實施例中，非水性液體載體包括至少兩種有機溶劑。

【0267】 在一些實施例中，有機溶劑為非芳族溶劑。在一些實施例中，非芳族溶劑為非質子性溶劑。

【0268】 在一些實施例中，有機溶劑係指共溶劑。

【0269】 式I化合物在溶劑中之溶解度視溶劑之極性而定。在一些實施例中，溶劑之極性在25-50之間(若水為100)。若溶劑之組合之極性在25-50之間，則可將溶劑(非水性液體載體)組合。在一些實施例中，水在溶劑中之溶解度小於25 g/l。在一些實施例中，溶劑在20°C下具有小於10，較佳地小於5之偶極(dipole; D)。在一些實施例中，溶劑具有高於1之Log P值。

【0270】 在一些實施例中，非水性載體係選自由以下組成之群組：

芳香烴、石蠟、石油、柴油、礦物油、脂肪酸酯及/或脂肪酸之醯胺、松油脂肪酸及其任何組合。

【0271】 在一些實施例中，非水性載體為芳族烴。

【0272】 在一些實施例中，芳族烴係選自由以下組成之群組：甲苯、鄰二甲苯、間二甲苯、對二甲苯、乙苯、異丙基苯、第三丁基苯、萘及經單烷基或多烷基取代之萘。

【0273】 在一些實施例中，有機溶劑為石蠟。

【0274】 在一些實施例中，非水性液體載體為植物油。在一些實施例中，植物油係選自由以下組成之群組：橄欖油、木棉油、蓖麻油、番木瓜油、山茶油、芥花油、棕櫚油、芝麻油、玉米油、米糠油、花生油、棉子油、大豆油、菜籽油、亞麻籽油、桐油、葵花籽油、紅花油及松油。

【0275】 在一些實施例中，非水性載體為脂肪酸酯。在一些實施例中，脂肪酸之烷基酯為芥酸C18甲酯。在一些實施例中，芥酸C18甲酯為Agnique® ME 18RD-F(BASF製造及銷售)。

【0276】 在一些實施例中，非水性載體為脂肪酸之醯胺。在一些實施例中，脂肪酸之醯胺係選自由以下組成之群組：C₁-C₃胺、烷基胺及烷醇胺與C₆-C₁₈羧酸。

【0277】 在一些實施例中，非水性載體為脂肪酸之烷基酯。在一些實施例中，脂肪酸之烷基酯係選自由以下組成之群組：C₈至C₂₂脂肪酸之C₁-C₄一元醇酯，諸如油酸甲酯及油酸乙酯。

【0278】 非水性載體之其他實例為脂肪酸甲酯、植物油烷基酯、二甲苯、辛醇、苯乙酮、環己酮、Solvesso™(ExxonMobil Chemical製造及銷售)、N-甲基吡咯啉酮、硫酸三丁酯(tributyl sulphate; TBP)、乳酸乙

基己基酯(ethyl hexyl lactate ; EHL)、脂肪酸之烷基(線性或環狀)醯胺(天然或合成)、乙酸芳基酯(乙酸苯甲酯)、聚碳酸伸乙酯、乙酸苯甲酯及碳酸伸丙酯。在一些實施例中，非水性載體為環己酮。在一些實施例中，非水性載體為苯乙酮。在一些實施例中，非水性載體為乙酸苯甲酯。在一些實施例中，非水性載體為碳酸伸丙酯。

(v) 其他添加劑

【0279】 本發明之組合物可進一步包括如本領域中已知之一或多種額外農業上可接受之惰性添加劑，包含(但不限於)固體稀釋劑、液體稀釋劑、潤濕劑、黏著劑、增稠劑、消泡劑、防腐劑、潤濕劑、抗氧化劑、黏合劑、肥料或抗冷凍劑。另外，本發明組合物亦可進一步包括本領域中已知之額外作物保護劑，例如農藥、安全劑、用於控制植物病原性真菌或細菌之藥劑及其類似者。

【0280】 在一些實施例中，液體穩定的液體組合物進一步包括流變改質劑。流變改質劑可用於降低相分離，以增加物理穩定性，及增加影響化學穩定性之黏度。

【0281】 在一些實施例中，流變改質劑為Bentone SD®-1(經改質之膨潤土)或Bentone SD®-3(經改質之鋰膨潤石)(由Elementis製造)。在一些實施例中，組合物中之Bentone SD®-1或Bentone SD®-3之量在0.5重量%與1.0重量%之間。在一些實施例中，流變改質劑為Attagel® 50(由BASF製造)及Bentone SD®-1。在一些實施例中，組合物中之Attagel® 50之量為0.5重量%，且組合物中之Bentone SD®-1之量為0.5重量%。使用Attagel® 50(按組合物之總重量計，0.5重量%)及Bentone SD®-1(按組合物之總重量計，0.5重量%)，在於40°C下儲存8週之後，式I化合物之降解

自7-8%降低至4%。組合物之水濃度應維持在小於0.5%，包含當Bentone SD®-1用作流變改質劑時。

【0282】 在一些實施例中，流變改質劑為三仙膠。

【0283】 在一些實施例中，流變改質劑為增稠劑。

【0284】 在一些實施例中，增稠劑為二氧化矽增稠劑。

【0285】 在一些實施例中，增稠劑係選自由以下組成之群組：
Aerosil® 200、Aerosil® R972、Aerosil® R202及其任何組合。

【0286】 在一些實施例中，二氧化矽增稠劑係選自由以下組成之群組：
Aerosil® R202、Aerosil® R812及其任何組合。

【0287】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物中之Aerosil® R202之量在1重量%與5重量%之間。在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物中之Aerosil® R202之量在1.7重量%與2.5重量%之間。

【0288】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物中之Aerosil® R812之量在1重量%與5重量%之間。在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物中之Aerosil® R812之量在3.0重量%與3.5重量%之間。

【0289】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物中之Bentone SD®-1或Bentone SD®-3之量在0.5重量%與1.0重量%之間。

【0290】 在一些實施例中，穩定的液體組合物中之流變改質劑之濃度為1 g/L至150 g/L。在一些實施例中，穩定的液體組合物中之流變改質劑之濃度為1 g/L至5 g/L。在一些實施例中，穩定的液體組合物中之流變改質劑之濃度為2.3 g/L。在一些實施例中，穩定的液體組合物中之流變

改質劑之濃度為0.5 g/L至130 g/L。在一些實施例中，穩定的液體組合物中之流變改質劑之濃度為3 g/L。

【0291】 在一些實施例中，組合物進一步包括至少一種佐劑。在一些實施例中，佐劑係選自由以下組成之群組：

- (i) 聚氧化烯烷基醚；
- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；
- (iv) 乙烯吡咯啉酮及其衍生物；及
- (v) 糖-基界面活性劑。

【0292】 在下文更詳細地描述較佳的佐劑。

【0293】 在一些實施例中，本發明組合物進一步包括額外可接受之惰性添加劑。在一些實施例中，農業上可接受之惰性添加劑係指(但不限於)抗氧化劑、消泡劑、染料、顏料、調味劑、分散劑、增效劑、囊封劑、光穩定劑、黏合劑、膠黏劑、水溶性肥料、忌避劑及敏化劑。

【0294】 在一些實施例中，方法進一步包括添加至少一種分散劑。

【0295】 在一些實施例中，穩定的液體組合物進一步包括分散劑。在一些實施例中，穩定的液體組合物中之分散劑之濃度為1 g/L至200 g/L。

【0296】 在一些實施例中，穩定的液體組合物進一步包括潤濕劑。在一些實施例中，潤濕劑為二異丙基萘磺酸鈉。在一些實施例中，穩定的組合物中之潤濕劑之濃度為1 g/L至10 g/L。在一些實施例中，穩定的組合物中之潤濕劑之濃度為5.5 g/L。

【0297】 在一些實施例中，穩定的液體組合物進一步包括增稠劑。

在一些實施例中，增稠劑為三仙膠。在一些實施例中，穩定的組合物中之增稠劑之濃度為0.25 g/L至10 g/L。在一些實施例中，穩定的組合物中之增稠劑之濃度為2 g/L。

【0298】 在一些實施例中，穩定的液體組合物進一步包括抗冷凍劑。在一些實施例中，抗冷凍劑為1,2-丙二醇。在一些實施例中，穩定的組合物中之抗冷凍劑之濃度為20 g/L至70 g/L。在一些實施例中，組合物中之抗冷凍劑之濃度為57.5 g/L。

【0299】 在一些實施例中，穩定的液體組合物進一步包括消泡劑。在一些實施例中，穩定的組合物中之消泡劑之濃度為1 g/L至5 g/L。在一些實施例中，組合物中之消泡劑之濃度為2 g/L。

【0300】 在一些實施例中，穩定的液體組合物進一步包括抗氧化劑。抗氧化劑包含(但不限於)黏土、BHA、BHT、TBH、沒食子酸丙酯、硫代硫酸鈉、生育酚、連苯三酚及表氯醇。

【0301】 在一些實施例中，穩定的液體組合物進一步包括消泡劑。消泡劑包含(但不限於)有機矽、EO/PO基去泡劑、聚丙烯酸烷基酯。

【0302】 在一些實施例中，穩定的液體組合物進一步包括染料。染料包含(但不限於)酸性染料、鹼性染料、天然染料、合成染料及偶氮染料。

【0303】 在一些實施例中，穩定的液體組合物進一步包括潤濕劑。潤濕劑之實例包含(但不限於)萘磺酸二烷基酯、磺基丁二酸二烷基酯、烷基醚磺酸酯之金屬鹽、 α 烯基磺酸鹽、N-醯基N-烷基牛磺酸鹽、直鏈烷基苯磺酸鹽、羧酸鹽、硫酸鹽、磷酸酯、聚氧化乙烯界面活性劑、乙氧基化烷基酚、乙氧基化脂族醇、脫水山梨醇酯及鯨蠟基三甲基溴化銨。

【0304】 在一些實施例中，穩定的液體組合物進一步包括界面活性劑。

【0305】 界面活性劑可包含(但不限於)醇聚乙二醇醚、烷基封端的乙氧基化物乙二醇、烷基封端的烷基嵌段烷氧基化物乙二醇、磺基丁二酸二烷基酯、磷酸鹽化的酯、磺酸烷基酯、磺酸烷基芳基酯、三苯乙烯基苯酚烷氧基化物、天然或合成脂肪酸烷氧基化物、天然或合成脂肪醇烷氧基化物、烷氧基化醇(諸如正丁醇聚二醇醚)、嵌段共聚物(諸如氧化乙烯-氧化丙烯嵌段共聚物及氧化乙烯-氧化丁烯嵌段共聚物)或其組合。

【0306】 在一些實施例中，界面活性劑為烷基封端的烷氧基化物。在一些實施例中，佐劑為甲基封端的乙氧基化物。在一些實施例中，佐劑為甲基封端的十三烷基乙氧基化物。在一些實施例中，佐劑為具有六個氧化乙烯之甲基封端的十三烷基乙氧基化物。

【0307】 在一些實施例中，界面活性劑為萘磺酸異丙酯。

【0308】 在一些實施例中，本文所揭示之組合物可包含額外農藥。

【0309】 所揭示之組合物可視情況包含組合，所述組合可包含至少1重量%之一或多種組合物與另一農藥化合物。此類額外農藥化合物可為殺真菌劑、殺昆蟲劑、殺線蟲劑、殺蟎劑、殺節肢動物劑、殺細菌劑或其組合，其在所選用於施用之介質中與本發明化合物相容且對本發明化合物之活性無拮抗性。因此，在此類實施例中，其他農藥式I化合物用作為其補充毒劑或用於不同農藥用途。農藥化合物及協同組合物一般可以1:100至100:1之重量比混合在一起。

包括式I化合物及佐劑之混合物：

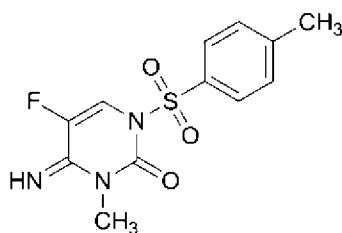
【0310】 佐劑為惰性化學品，添加其以用於增加活性成分及其組合

物之效能。增強式I化合物之活性尤其具有挑戰性，此係因為觀測到許多缺點，諸如快速漂移、葉片上液滴之高表面張力，此大大地影響及限制滲透至植物中。

【0311】 發現，施用所選擇佐劑中之至少一者與式(I)化合物增強式(I)化合物在控制真菌攻擊植物上之功效。所選擇佐劑可內置於包括式I化合物之組合物中。所選擇佐劑亦可添加至包括式I化合物之槽式混合物中。另外，若使用多於一種佐劑，則可將佐劑中之一或多者內置於組合物中，而將其他佐劑添加至槽式混合物中。

【0312】 本發明提供一種殺真菌混合物，其包括：

(a) 殺真菌有效量之式I化合物：



式I ; 及

(b) 選自由以下組成之群組之至少一種佐劑：

- (i) 聚氧化烯烷基醚；
- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；
- (iv) 乙烯吡咯啉酮及其衍生物；及
- (v) 糖基界面活性劑。

【0313】 在一些實施例中，殺真菌混合物為組合物。在一些實施例中，殺真菌混合物為槽式混合物。

【0314】 在一些實施例中，式I化合物係在組合物中。在一些實施例

中，式I化合物係在穩定的液體組合物中。式I化合物之穩定的液體組合物包含(但不限於)本文所揭示之穩定的液體組合物。在一些實施例中，穩定的液體組合物為懸浮液濃縮物(SC)組合物。在一些實施例中，穩定的液體組合物為懸乳劑(SE)組合物。在一些實施例中，穩定的液體組合物為油分散液(OD)組合物。在一些實施例中，穩定的液體組合物為可乳化濃縮物(EC)組合物。

【0315】 在一些實施例中，聚氧化烯烷基醚為聚烷氧基化醇。

【0316】 在一些實施例中，聚氧化烯烷基醚之烷基包括(但不限於)包括C1-C26之碳水化合物鏈。

【0317】 在一些實施例中，聚烷氧基化醇之醇包括(但不限於)C1-C26之碳水化合物鏈。

【0318】 在一些實施例中，聚氧化烯烷基醚之烷基包括(但不限於)短碳水化合物鏈及長碳水化合物鏈。

【0319】 碳水化合物鏈可指(但不限於)飽和鏈、不飽和鏈、分支鏈及未分支鏈。

【0320】 在一些實施例中，短鏈係指C1-C8。在一些實施例中，長鏈係指C9-C26。

【0321】 在一些實施例中，聚氧化烯係指(但不限於)聚氧化乙烯、聚氧化丙烯、聚氧化丁烯或其組合。

【0322】 在一些實施例中，聚氧化烯包含(但不限於)共聚物。共聚物係指嵌段共聚物，諸如聚氧化乙烯-聚氧化丙烯；及/或無規共聚物，諸如氧化乙烯-氧化丙烯。在一些實施例中，聚氧化烯嵌段共聚物為二嵌段共聚物。在一些實施例中，聚氧化烯嵌段共聚物為三嵌段共聚物。

【0323】 在一些實施例中，三嵌段共聚物為聚氧化乙烯/聚氧化丙烯/聚氧化乙炔。

【0324】 在一些實施例中，聚氧化烯烷基醚為烷基封端的。在一些實施例中，烷基包含(但不限於)短碳水化合物鏈及長碳水化合物鏈。碳水化合物鏈可指(但不限於)飽和鏈、不飽和鏈、分支鏈及未分支鏈。在一些實施例中，短鏈係指C1-C8。

【0325】 在一些實施例中，聚氧化烯烷基醚為異十三烷醇聚乙二醇醚。

【0326】 在一些實施例中，聚氧化烯烷基醚為C16-C18醇乙氧基化物丙氧基化物醚。

【0327】 在一些實施例中，C16-C18醇乙氧基化物丙氧基化物醚為由Akzo Nobel Agrochemicals製造及銷售之Ethylan™ 995。在一些實施例中，C16-C18醇乙氧基化物丙氧基化物醚為由BASF製造及銷售之Agnique® BP420。

【0328】 在一些實施例中，聚氧化烯烷基醚為乙氧基化物丙氧基化物醇。

【0329】 在一些實施例中，乙氧基化物丙氧基化物醇為由Croda製造及銷售之Synperonic™ 13/9。在一些實施例中，乙氧基化物丙氧基化物醇為由Croda製造及銷售之Atplus™ PFA。

【0330】 在一些實施例中，聚氧化烯烷基醚為異十三烷醇聚乙二醇醚。

【0331】 在一些實施例中，異十三烷醇聚乙二醇醚為由Clariant製造及銷售之Genapol® X80。在一些實施例中，異十三烷醇聚乙二醇醚為由

BASF製造及銷售之Trycol®。

【0332】 在一些實施例中，聚氧化烯烷基醚對降低組合物之表面張力及改良植物葉片上之式I化合物之擴散有效。降低表面張力使得自葉片之漂移降低。

【0333】 在一些實施例中，矽氧烷聚氧化烯共聚物係指有機改質的三矽氧烷。

【0334】 在一些實施例中，矽氧烷聚氧化烯共聚物為來自Evonik之Break-Thru® S233。在一些實施例中，矽氧烷聚氧化烯共聚物為來自Momentive之Silwett® 077。

【0335】 在一些實施例中，矽氧烷聚氧化烯共聚物對降低組合物之表面張力有效。發現聚矽氧界面活性劑為降低親脂性表面上之組合物之表面張力且在其上快速擴散之有效藥劑。

【0336】 在一些實施例中，脂肪酸酯可包含(但不限於)脂肪酸及植物油之烷基酯。

【0337】 在一些實施例中，烷基酯包括含C10-C20之碳水化合物鏈。

【0338】 在一些實施例中，烷基包含(但不限於)短碳水化合物鏈

【0339】 碳水化合物鏈可指(但不限於)飽和鏈、不飽和鏈、分支鏈及未分支鏈。

【0340】 在一些實施例中，短鏈係指C1-C8。在一些實施例中，脂肪酸烷基酯為來自Solvay之Rhodaphac® PA/23(乙氧基化脂肪醇之磷酸酯)或來自Solvay之Alkamuls® VO/2003(乙氧基化(18EO)脂肪酸)。

【0341】 在一些實施例中，佐劑為乙氧基化十三烷醇或聚氧化乙烯

(9)異十三醇。

【0342】 在一些實施例中，植物油(plant oil)包含(但不限於)植物油(vegetable oil)及其衍生物。

【0343】 在一些實施例中，植物油包含(但不限於)籽油、椰子油、菜籽油、蓖麻油、大豆油、棕櫚油及玉米油。

【0344】 在一些實施例中，植物油之衍生物係指烷基酯、聚氧化烯。

【0345】 聚氧化烯係指聚氧化乙烯、聚氧化丙烯、聚氧化丁烯及其組合。

【0346】 在一些實施例中，植物油及其衍生物包含(但不限於)菜籽油甲基化酯及聚甘油醚之椰子脂肪酸酯。

【0347】 在一些實施例中，佐劑為甲基化籽油與聚甘油酯之混合物。

【0348】 在一些實施例中，菜籽油甲基化酯為由BASF製造及銷售之Agnique® ME 18 RDF。

【0349】 在一些實施例中，植物油之聚氧化烯衍生物為聚甘油醚之椰子脂肪酸酯。

【0350】 在一些實施例中，聚甘油醚之椰子脂肪酸酯為由Clariant製造及銷售之Synergen® GL5。

【0351】 在一些實施例中，脂肪酸酯軟化葉片之表面特性，以使式I化合物較佳及有效滲透。

【0352】 在一些實施例中，乙烯吡咯啉酮之衍生物為乙烯吡咯啉酮與乙酸乙烯酯(VP/VA)之嵌段共聚物。

【0353】 在一些實施例中，乙烯吡咯啉酮與乙酸乙烯酯之嵌段共聚物為由Ashland製造及銷售之Sokalan® VA 64 P。

【0354】 在一些實施例中，乙烯吡咯啉酮與乙酸乙烯酯之嵌段共聚物為由Ashland製造及銷售之Agrimer™ VA 6。

【0355】 在一些實施例中，乙烯吡咯啉酮(vinylpyrrolidone；PVP)及其衍生物對增加式I化合物黏著至植物葉片有效，以用於改良黏著及保留特性(例如耐雨)。

【0356】 糖基界面活性劑可包含(但不限於)脫水山梨糖醇酯、蔗糖酯、烷基多醣苷及脂肪酸葡萄糖醯胺。

【0357】 在一些實施例中，糖基界面活性劑為葡萄糖醯胺之烷基或脂肪酸衍生物。

【0358】 在一些實施例中，糖基界面活性劑為烷基葡萄糖醯胺。

【0359】 在一些實施例中，脂肪酸葡萄糖醯胺為C8/C10脂肪酸葡萄糖醯胺。

【0360】 在一些實施例中，C8/C10脂肪酸葡萄糖醯胺為來自Clariant之Synergen® GA。

【0361】 在一些實施例中，糖基界面活性劑為脫水山梨糖醇及其衍生物。

【0362】 在一些實施例中，脫水山梨糖醇之衍生物為聚氧化乙烯衍生物及脂肪酸酯。

【0363】 在一些實施例中，脫水山梨糖醇為二或三脂肪酸酯。在一些實施例中，脫水山梨糖醇之衍生物為包括20至80個氧化乙基團之聚氧化乙烯衍生物。

【0364】 在一些實施例中，脫水山梨糖醇之衍生物為Tween® 80。

【0365】 在一些實施例中，糖基界面活性劑影響葉片表面，以改良式I化合物滲透通過葉片表面。

【0366】 在一些實施例中，殺真菌混合物包括多佐劑系統。多佐劑系統係指佐劑之摻合物或任何組合。

【0367】 在一些實施例中，殺真菌混合物包括至少兩種佐劑。在一些實施例中，殺真菌混合物包括至少三種佐劑。

【0368】 在一些實施例中，佐劑以不同方式影響滲透。在一些實施例中，佐劑以相同方式影響滲透。

【0369】 在一些實施例中，佐劑之摻合物包含(但不限於)烷基脂肪酸酯與脂肪醇之組合。

【0370】 在一些實施例中，烷基脂肪酸酯與脂肪醇烷氧基化物之組合為由Clariant製造及銷售之Synergen® SOC。

【0371】 在一些實施例中，烷基脂肪酸酯及脂肪醇烷氧基化物之組合為由Clariant製造及銷售之FOP。

【0372】 在一些實施例中，佐劑之摻合物包含(但不限於)植物油及/或其衍生物與糖基界面活性劑之組合。

【0373】 在一些實施例中，混合物中之化合物(I)之量在1重量%-99.99重量%之間。

【0374】 在一些實施例中，混合物中之佐劑之量在0.01重量%-95重量%與之間。

【0375】 在一些實施例中，式I化合物與佐劑之重量比之範圍為50:1至1:50。在一些實施例中，式I化合物與佐劑之重量比之範圍為10:1至

1:10。在一些實施例中，式I化合物與佐劑之重量比之範圍為5:1至1:5。在一些實施例中，式I化合物與佐劑之重量比為1:1。

【0376】 在一些實施例中，式I化合物與佐劑之體積比之範圍為50:1至1:50。在一些實施例中，式I化合物與佐劑之體積比之範圍為10:1至1:10。在一些實施例中，式I化合物與佐劑之體積比之範圍為5:1至1:5。式I化合物與佐劑之體積比為1:1。

【0377】 在一些實施例中，式I化合物與具有乙烯吡咯啉酮及其衍生物結構之佐劑之重量比為25:1。

【0378】 在一些實施例中，式I化合物與具有矽氧烷聚氧化烯共聚物結構之佐劑之重量比為50:1。

【0379】 在一個實施例中，混合物中之聚氧化烯烷基醚與式I化合物之間的重量比為1:90。

【0380】 在一個實施例中，混合物中之植物油及其衍生物與式I化合物之間的重量比為1:90。

【0381】 在一個實施例中，混合物中乙烯吡咯啉酮及其衍生物與式I化合物之間的重量比為1:90。

【0382】 在一個實施例中，混合物中糖基界面活性劑與式I化合物之間的重量比為1:90。

【0383】 在一些實施例中，兩種佐劑之間的重量比之範圍為5:1至1:5。在一些實施例中，兩種佐劑之間的重量比為2:1至1:2。在一些實施例中，兩種佐劑之間的重量比為1:1。

【0384】 在一些實施例中，具有乙烯吡咯啉酮及其衍生物結構之佐劑與具有矽氧烷聚氧化烯共聚物結構之佐劑之間的重量比之範圍為5:1至

1:5。在一些實施例中，具有乙烯吡咯啉酮及其衍生物結構之佐劑與具有矽氧烷聚氧化烯共聚物結構之佐劑之間的重量比為2:1。在一些實施例中，具有乙烯吡咯啉酮及其衍生物結構之佐劑與具有矽氧烷聚氧化烯共聚物結構之佐劑之間的重量比為1.4:1。

【0385】 在一些實施例中，具有乙烯吡咯啉酮及其衍生物結構之佐劑與具有聚氧化烯烷基醚結構之佐劑之間的重量比之範圍為10:1至1:10。在一些實施例中，具有乙烯吡咯啉酮及其衍生物結構之佐劑與具有聚氧化烯烷基醚結構之佐劑之間的重量比為1:5.5。

【0386】 在一些實施例中，具有乙烯吡咯啉酮及其衍生物結構之佐劑與具有脂肪酸酯結構之佐劑之間的重量比之範圍為5:1至1:5。在一些實施例中，具有乙烯吡咯啉酮及其衍生物結構之佐劑與具有脂肪酸酯結構之佐劑之間的重量比為1:3.7。

【0387】 在一些實施例中，具有聚氧化烯烷基醚結構之佐劑與具有脂肪酸酯結構之佐劑之間的重量比之範圍為5:1至1:5。在一些實施例中，具有聚氧化烯烷基醚結構之佐劑與具有脂肪酸酯結構之佐劑之間的重量比之範圍為1.5:1。

【0388】 在一些實施例中，具有聚氧化烯烷基醚結構之佐劑與具有脂肪酸酯之佐劑與具有乙烯吡咯啉酮及其衍生物結構之佐劑之間的重量比之範圍為10:5:1至1:5:10。在一些實施例中，具有聚氧化烯烷基醚結構之佐劑與具有脂肪酸酯之佐劑與具有乙烯吡咯啉酮及其衍生物結構之佐劑之間的重量比之範圍為5.7:3.76:1。

【0389】 在一些實施例中，多佐劑系統中之兩種佐劑之重量比範圍係在5:1至1:5之間，或1:3至3:1或1:2至2:1或1:1。

【0390】 在一些實施例中，式I化合物與佐劑之重量比為5:1至1:5，或1:3至3:1或1:2至2:1或1:1。

【0391】 在一些實施例中，混合物中之式I化合物與佐劑之重量比為5:1至1:5，或1:3至3:1，或1:2至2:1或1:1。

【0392】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，內置式佐劑以至少0.1重量%之量存在。在一些實施例中，按組合物之總重量計，佐劑以至少10重量%之量存在。在一些實施例中，按組合物之總重量計，佐劑以至少15重量%之量存在。在一些實施例中，按組合物之總重量計，佐劑以至多30重量%之量存在。

【0393】 在一些實施例中，本發明之混合物調配為一種組合物，稱為內置式組合物。在一些實施例中，將混合物調配成兩種單獨組合物，且將組合物添加在槽式混合物中。

【0394】 在一些實施例中，槽式混合物中之佐劑與化合物(I)之比率為50:1至1:50。

【0395】 在一些實施例中，式I化合物與佐劑之體積比之範圍為50:1至1:50。在一些實施例中，式I化合物與佐劑之體積比之範圍為10:1至1:10。在一些實施例中，式I化合物與佐劑之體積比之範圍為5:1至1:5。式I化合物與佐劑之體積比為1:1。

【0396】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物/混合物中之具有聚氧化烯烷基醚結構之佐劑之濃度為至少3重量%。

【0397】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物/混合物中之具有矽氧烷聚氧化烯共聚物結構之佐劑之濃度為至少5重量%。

【0398】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物/混合物中

之具有脂肪酸酯結構之佐劑之濃度為至少3重量%。

【0399】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物/混合物中之具有乙烯吡咯啉酮及其衍生物結構之佐劑之濃度係在0.1重量%與2.5重量%之間。

【0400】 在一些實施例中，組合物/混合物中之具有糖基界面活性劑結構之佐劑之濃度為至少3重量%。

【0401】 在一些實施例中，當按組合物之總重量計，組合物中之聚氧化烯烷基醚濃度小於3重量%時，聚氧化烯烷基醚用作界面活性劑/乳化劑。

【0402】 在此方面，當按組合物之總重量計，組合物中之矽氧烷聚氧化烯共聚物濃度小於5重量%時，矽氧烷聚氧化烯共聚物用作界面活性劑/乳化劑。

【0403】 在此方面，當按組合物之總重量計，組合物中之脂肪酸酯濃度小於3重量%時，脂肪酸酯用作界面活性劑/乳化劑。

【0404】 在此方面，當按組合物之總重量計，組合物中之糖基界面活性劑濃度小於3重量%時，糖基界面活性劑用作界面活性劑/乳化劑。

【0405】 在一些實施例中，化合物(I)及/或佐劑之組合物為液體組合物、固體組合物或其組合。

【0406】 液體組合物之實例為懸浮液濃度(SC)組合物、油分散液(OD)組合物或可乳化濃縮物(EC)組合物。

【0407】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物與佐劑之混合物中或組合物中之聚氧化烯烷基醚之量在約1重量%至約5重量%之範圍內。

【0408】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物與佐劑之混合物中或組合物中之矽氧烷聚氧化烯共聚物之量在約1重量%至約5重量%之範圍內。

【0409】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物與佐劑之混合物中或組合物中之脂肪酸烷基酯之量在約1重量%至約5重量%之範圍內。

【0410】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物與佐劑之混合物中或組合物中之植物油及其衍生物之量在約1重量%至約5重量%之範圍內。

【0411】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物與佐劑之混合物中或組合物中之乙烯吡咯啉酮及其衍生物之量在約1重量%至約5重量%之範圍內。

【0412】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物與佐劑之混合物中或組合物中之糖基界面活性劑之量在約1重量%至約5重量%之範圍內。

【0413】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物與佐劑之混合物中或組合物中之聚氧化烯烷基醚之量在約1重量%至約5重量%之範圍內。

【0414】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物與佐劑之混合物中或組合物中之矽氧烷聚氧化烯共聚物之量在約1重量%至約5重量%之範圍內。

【0415】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物與佐劑之混合物中或組合物中之脂肪酸烷基酯之量在約1重量%至約5重量%之範圍內。

圍內。

【0416】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物與佐劑之混合物中或組合物中之植物油及其衍生物之量在約1重量%至約5重量%之範圍內。

【0417】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物與佐劑之混合物中或組合物中之乙烯吡咯啉酮及其衍生物之量在約1重量%至約5重量%之範圍內。

【0418】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物與佐劑之混合物中或組合物中之糖基界面活性劑之量在約1重量%至約5重量%之範圍內。

【0419】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，包括式I化合物之組合物中之聚氧化烯烷基醚之濃度為5重量%。

【0420】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，包括式I化合物之組合物中之矽氧烷聚氧化烯共聚物之濃度為0.1重量%。

【0421】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物之組合物中之脂肪酸烷基酯之濃度為5重量%。

【0422】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，包括式I化合物之組合物中之植物油及其衍生物之濃度為6重量%。

【0423】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，包括式I化合物之組合物中之乙烯吡咯啉酮及其衍生物之濃度為1.5重量%。

【0424】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，包括式I化合物之組合物中之糖基界面活性劑之濃度為5重量%。

【0425】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物與佐劑

之混合物中或組合物中之聚氧化烯烷基醚之量在約1重量%至約5重量%之範圍內。

【0426】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物與佐劑之混合物中或組合物中之矽氧烷聚氧化烯共聚物之量在約1重量%至約5重量%之範圍內。

【0427】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物與佐劑之混合物中或組合物中之脂肪酸烷基酯之量在約1重量%至約5重量%之範圍內。

【0428】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物與佐劑之混合物中或組合物中之植物油及其衍生物之量在約1重量%至約5重量%之範圍內。

【0429】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物與佐劑之混合物中或組合物中之乙烯吡咯啉酮及其衍生物之量在約1重量%至約5重量%之範圍內。

【0430】 在一個實施例中，按組合物之總重量計，式I化合物與佐劑之混合物中或組合物中之糖基界面活性劑之量在約1重量%至約5重量%之範圍內。

【0431】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物中之VP/VA之濃度為約1重量%-3重量%。在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物中之VP/VA之濃度為約1.5重量%。

【0432】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物中之PVP之濃度為約0.5重量%-1.5重量%。在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物中之PVP之濃度為約0.75重量%-1.25重量%。

【0433】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物中之矽氧烷聚氧化烯共聚物之濃度為約0.25重量%-2.5重量%。在一些實施例中，按組合物之總重量計，組合物中之VP/VA之濃度為約0.1重量%-2.0重量%。

【0434】 在一些實施例中，多佐劑系統中之佐劑具有類似特性。

【0435】 在一些實施例中，多佐劑系統中之佐劑具有不同特性。

【0436】 在一些實施例中，佐劑影響葉片之表面特性。

【0437】 在一些實施例中，佐劑影響組成物之物理特性。

【0438】 在一些實施例中，一種佐劑或多佐劑系統/摻合物影響在稀釋之後液滴/組合物/組合物之表面張力；充當黏著劑；改良式I化合物在葉片上之擴散。

【0439】 在一些實施例中，式I化合物之滲透藉由降低組合物之表面張力來增加，因此將調配物擴展在葉片之表面上且增強滲透。

【0440】 在一些實施例中，佐劑亦用作為溶劑、界面活性劑、潤濕劑、分散劑及/或界面活性劑。

【0441】 在一些實施例中，組合物溶劑、界面活性劑、潤濕劑、分散劑及/或界面活性劑亦用作為佐劑。

【0442】 在一些實施例中，Agnique® ME 18 RD-F(脂肪酸，C16-18及C18不飽和甲酯)為溶劑及內置式佐劑。

【0443】 在一些實施例中，Genapol® x80(異十三烷醇聚乙二醇醚非離子性界面活性劑)為乳化劑/界面活性劑及內置式佐劑。

【0444】 在一些實施例中，Agnique® ME 18 RD-F(脂肪酸，C16-18及C18-不飽和甲酯)為OD組合物中之溶劑及內置式佐劑。

【0445】 在一些實施例中，Genapol® x80(異十三烷醇聚乙二醇醚非離子性界面活性劑)為OD組合物中之乳化劑/界面活性劑及內置式佐劑。

【0446】 在一些實施例中，溶劑Agnique® ME 18 RD-F(脂肪酸，C16-18及C18-不飽和甲酯)亦為內置式佐劑。

【0447】 在一些實施例中，乳化劑/界面活性劑Genapol® x80(異十三烷醇聚乙二醇醚非離子性界面活性劑)亦為內置式佐劑。

【0448】 在一些實施例中，OD組合物中之溶劑Agnique® ME 18 RD-F(脂肪酸，C16-18及C18-不飽和甲酯)亦為內置式佐劑。

【0449】 在一些實施例中，OD組合物中之乳化劑/界面活性劑Genapol® x80(異十三烷醇聚乙二醇醚非離子性界面活性劑)亦為內置式佐劑。

【0450】 根據農業化學技術中習知但因為其中存在化合物(I)與佐劑之所揭示混合物而為新穎且重要的程序，來製備組合物。

【0451】 可將所揭示之混合物之濃縮組合物分散於水或另一液體中以用於施用，或組合物可為粉塵狀或顆粒狀，其隨後可進行施用而無需其他處理或可在施用之前稀釋。

【0452】 最常施用之組合物為水性懸浮液或乳液。此類水溶性、水可懸浮或可乳化組合物為固體，通常被稱為可濕潤粉末；或液體，通常被稱為可乳化濃縮物、水性懸浮液、懸浮液濃縮物或懸乳劑。本發明涵蓋可調配混合物以用於遞送且用作殺真菌劑的所有媒劑。

額外農用化學品：

【0453】 本發明之混合物及組合物可進一步包括一或多種額外農用

化學品。

【0454】 在一些實施例中，本發明之組合物進一步包括至少一種額外農藥。在一些實施例中，農藥為殺真菌劑、除草劑、殺昆蟲劑或殺線蟲劑。

【0455】 在一些實施例中，本發明之組合物進一步包括至少一種額外殺真菌劑。在一些實施例中，本發明之殺真菌混合物進一步包括至少一種額外殺真菌劑。

【0456】 在一些實施例中，所述至少一種額外殺真菌劑為殺真菌固醇生物合成抑制劑。

【0457】 在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑係選自由以下組成之群組：丙硫菌唑(prothioconazole)、氟環唑(epoxiconazole)、環克座(cyproconazole)、腈菌唑(myclobutanil)、咪醯胺(prochloraz)、葉菌唑(metconazole)、苯醚甲環唑(difenoconazole)、戊唑醇(tebuconazole)、四氟醚唑(tetraconazole)、腈苯唑(fenbuconazole)、丙環唑(propiconazole)、氟喹唑(flusilazole)、粉唑醇(flutriafol)及芬普福(fenpropimorph)。

【0458】 在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑係選自由以下組成之群組：丙硫菌唑、氟環唑、葉菌唑、苯醚甲環唑、丙環唑、咪醯胺、四氟醚唑、戊唑醇、芬普福、苯鏽啉(fenpropidin)、種菌唑(ipconazole)、滅菌唑(triticonazole)、螺環菌胺(spiroxamine)、環醯菌胺(fenhexamid)及胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)。

【0459】 在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為丙硫菌唑。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為氟環唑。在一些實施例中，固醇生物

合成抑制劑為環克座。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為腓菌唑。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為葉菌唑。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為苯醚甲環唑。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為丙環唑。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為咪醯胺。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為四氟醚唑。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為戊唑醇。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為氟唑唑。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為氟矽唑。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為粉唑醇。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為芬普福。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為苯鏽啉。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為種菌唑。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為滅菌唑。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為螺環菌胺。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為環醯菌胺。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為胺苯吡菌酮。在一些實施例中，固醇生物合成抑制劑為腓苯唑。

【0460】 在一些實施例中，所述至少一種額外殺真菌劑為丁二酸脫氫酶抑制劑。

【0461】 在一些實施例中，丁二酸脫氫酶抑制劑係選自由以下組成之群組：苯丙烯氟菌唑(benzovindiflupyr)、吡噻菌胺(penthiopyrad)、吡唑萘菌胺(isopyrazam)、氟唑菌醯胺(fluxapyroxad)、啞醯菌胺(boscalid)、氟吡菌醯胺(fluopyram)、聯苯吡菌胺(bixafen)及噴福芬(penflufen)。

【0462】 在一些實施例中，丁二酸脫氫酶抑制劑為苯丙烯氟菌唑。在一些實施例中，丁二酸脫氫酶抑制劑為吡噻菌胺。在一些實施例中，丁二酸脫氫酶抑制劑為吡唑萘菌胺。在一些實施例中，丁二酸脫氫酶抑制劑

為氟唑菌醯胺。在一些實施例中，丁二酸脫氫酶抑制劑為啞醯菌胺。在一些實施例中，丁二酸脫氫酶抑制劑為氟吡菌醯胺。在一些實施例中，丁二酸脫氫酶抑制劑為聯苯吡菌胺。在一些實施例中，丁二酸脫氫酶抑制劑為噴福芬。

【0463】 在一些實施例中，所述至少一種額外殺真菌劑為嗜毬果傘素(strobilurin)殺真菌劑。

【0464】 在一些實施例中，嗜毬果傘素殺真菌劑係選自由以下組成之群組：啞菌酯(azoxystrobin)、啞菌胺酯(pyraclostrobin)、啞氧菌酯(picoxystrobin)、氟啞菌酯(fluxastrobin)、肱菌酯(trifloxystrobin)、醚菌酯(kresoxim - methyl)、醚菌胺(dimoxystrobin)及肱醚菌胺(orysastrobin)。

【0465】 在一些實施例中，嗜毬果傘素殺真菌劑係選自由以下組成之群組：啞菌酯、啞菌胺酯、啞氧菌酯、氟啞菌酯及肱菌酯

【0466】 在一些實施例中，嗜毬果傘素殺真菌劑為啞菌酯。在一些實施例中，嗜毬果傘素殺真菌劑為啞菌胺酯。在一些實施例中，嗜毬果傘素殺真菌劑為啞氧菌酯。在一些實施例中，嗜毬果傘素殺真菌劑為氟啞菌酯。在一些實施例中，嗜毬果傘素殺真菌劑為肱菌酯。在一些實施例中，嗜毬果傘素殺真菌劑為醚菌酯。在一些實施例中，嗜毬果傘素殺真菌劑為醚菌胺。在一些實施例中，嗜毬果傘素殺真菌劑為肱醚菌胺。

【0467】 在一些實施例中，所述至少一種額外殺真菌劑為殺真菌多位點抑制劑。

【0468】 在一些實施例中，殺真菌多位點抑制劑係選自由以下組成之群組：鋅錳乃浦(mancozeb)、四氯異苯腈(chlorothalonil)、福爾培

(folpet)、蓋普丹(captan)、免得爛(metiram)、錳乃浦(maneb)、甲基鋅乃浦(propineb)、氫氧化銅、辛酸銅、鹼性氯氧化銅、硫酸銅、硫酸銅(三價)、代森錳銅、喹啉銅(oxine-copper)、雙(3-苯基水楊酸)銅、鉻酸銅鋅、氧化亞銅、硫酸肼銅及福美銅氨(cuprobam)。

【0469】 在一些實施例中，殺真菌多位點抑制劑為鋅錳乃浦。在一些實施例中，殺真菌多位點抑制劑為四氯異苯腈。在一些實施例中，殺真菌多位點抑制劑為福爾培。在一些實施例中，殺真菌多位點抑制劑為蓋普丹。在一些實施例中，殺真菌多位點抑制劑為免得爛。在一些實施例中，殺真菌多位點抑制劑為錳乃浦。在一些實施例中，殺真菌多位點抑制劑為甲基鋅乃浦。在一些實施例中，殺真菌多位點抑制劑為氫氧化銅、辛酸銅、鹼性氯氧化銅、硫酸銅、硫酸銅(三價)、代森錳銅、喹啉銅、雙(3-苯基水楊酸)銅、鉻酸銅鋅、氧化亞銅、硫酸肼銅或福美銅氨。

【0470】 在一些實施例中，額外殺真菌劑係選自由以下組成之群組：2-(硫氰基甲硫基)-苯并噻唑、2-苯基苯酚、8-羥基喹啉硫酸鹽、辛唑嘧菌胺、吡啶嘧菌胺、抗微素、白粉寄生孢、氧環唑、嘧菌酯、枯草桿菌、枯草桿菌菌株QST713、本達樂(benlaxyl)、免賴得(benomyl)、苯噻菌胺(benthiavalicarb-isopropyl)、苯甲基胺基苯-磺酸鹽(benzylaminobenzene-sulfonate；BABS)、碳酸氫鹽、聯苯基、噻枯唑(bismerthiazol)、比多農(bitertanol)、聯苯吡菌胺(bixafen)、殺稻瘟菌素(blasticidin)-S、硼砂、波爾多液(Bordeaux)混合物、啞醞菌胺(boscalid)、糠菌唑(bromuconazole)、布瑞莫(bupirimate)、聚硫化鈣(calcium polysulfide)、四氯丹(captafol)、蓋普丹、貝芬替(carbendazim)、萎鏽靈(carboxin)、加普胺(carpropamid)、香芹酮

(carvone)、氯芬酮(chlazafenone)、地茂散(chloroneb)、四氯異苯腈、克
氯得(chlozolate)、盾殼黴(Coniothyrium minitans)、氫氧化銅、辛酸
銅、鹼性氫氧化銅、硫酸銅、硫酸銅(三價)、氧化亞銅、賽座滅
(cyazofamid)、環氟菌胺、克絕(cymoxanil)、環克座、嘍菌環胺、邁隆
(dazomet)、咪菌威(debacarb)、伸乙基雙-(二硫胺基甲酸)二銨、益發靈
(dichlofluanid)、二氯酚、二氯西莫(diclocymet)、達滅淨
(diclomezine)、氯硝胺(dichloran)、乙黴威(diethofencarb)、苯醚甲環唑
(difenoconazole)、野燕枯離子(difenzoquat ion)、二氟林
(diflumetorim)、達滅芬(dimethomorph)、醚菌胺、達克利
(diniconazole)、達克利-M、大脫蟎(dinobuton)、白粉克(dinocap)、二苯
胺、腈硫醯(dithianon)、嗎菌靈(dodemorph)、嗎菌靈乙酸鹽(dodemorph
acetate)、多寧(dodine)、多寧游離鹼、護粒松(edifenphos)、烯肟菌酯
(enestrobin)、烯肟菌酯(enestroburin)、氟環唑、噻唑菌胺、乙氧喹
(ethoxyquin)、依得利(etridiazole)、凡殺同(famoxadone)、咪唑菌酮
(fenamidone)、芬瑞莫、腈苯唑、甲呋醯胺、環醯菌胺、氟菌胺
(fenoxanil)、拌種咯(fenpiclonil)、苯鏽啉、芬普福、胺苯吡菌酮、三苯
錫(fentin)、乙酸三苯錫、氫氧化三苯錫、福美鐵(ferbam)、富米綜
(ferimzone)、扶吉胺(fluzinam)、護汰寧(fludioxonil)、氟嗎啉、氟吡菌
胺、氟吡菌醯胺、唑呋草(fluoroimide)、氟嘍菌酯、氟喹唑
(fluquinconazole)、氟矽唑、氟硫滅(flusulfamide)、氟替尼(flutianil)、
福多寧(flutolanil)、粉唑醇、氟唑菌醯胺、福爾培、甲醛、乙磷
(fosetyl)、乙磷-鋁、麥穗靈(fuberidazole)、呋霜靈(furalaxyl)、福拉比
(furametpyr)、雙胍鹽(guazatine)、乙酸雙胍鹽、GY-81、六氯苯

(hexachlorobenzene)、菲克利(hexaconazole)、惡黴靈(hymexazol)、依滅列(imazalil)、硫酸依滅列、亞胺唑(imibenconazole)、克熱淨(iminoctadine)、三乙酸克熱淨、克熱淨三(烷苯磺酸鹽)、伊朵卡(iodocarb)、種菌唑、伊普吡唑啉酮(ipfenpyrazolone)、丙基喜樂松(iprobenfos)、依普同(iprodione)、顯黴威(iprovalicarb)、稻瘟靈(isoprothiolane)、吡唑萘菌胺(isopyrazam)、異噻菌胺(isotianil)、春日黴素(kasugamycin)、春日黴素鹽酸鹽水合物、甲氧醚菌酯(kresoxium-methyl)、昆布糖(laminarin)、代森錳銅、鋅錳乃浦、雙炔醯菌胺、錳乃浦、右滅達樂(mefenoxam)、噻菌胺(mepanipyrim)、滅普寧(mepronil)、甲庚白粉克(meptyl-dinocap)、氯化汞、氧化汞、氯化亞汞、滅達樂(metalaxyl)、滅達樂-M、威百畝(metam)、威百畝-鉍、威百畝-鉀、威百畝鈉、葉菌唑、滅速克(methasulfocarb)、碘甲烷、異硫氰酸甲酯、免得爛、苯氧菌胺(metominostrobin)、滅芬農(metrafenone)、米多黴素(mildiomyacin)、腓菌唑、代森鈉(nabam)、酞菌酯(nitrothal-isopropyl)、尼瑞莫(nuarimol)、辛噻酮(octhilinone)、呋醯胺(ofurace)、油酸(脂肪酸)、脞醚菌胺、歐殺斯(oxadixyl)、啞啞啞反丁烯二酸鹽、嘉保信(oxycarboxin)、披扶座(pefurazoate)、平克座(penconazole)、賓克隆(pencycuron)、噴福芬、五氯苯酚、月桂酸五氯苯基酯、吡噻菌胺(penthiopyrad)、乙酸苯基汞、膦酸、苯酞、啞啞啞菌酯、保粒黴素(polyoxin)B、多氧菌素(polyoxins)、保粒黴素、碳酸氫鉀、羥基啞啞啞硫酸鉀、撲殺熱(probenazole)、咪醯胺(prochloraz)、撲滅寧(procymidone)、霜黴威、鹽酸霜黴威、丙環唑、甲基鋅乃浦(propineb)、丙氧啞啞、丙硫菌唑、啞菌胺酯、啞菌胺酯、啞菌酯、白粉松

(pyrazophos)、吡菌苯威(pyribencarb)、稗草丹(pyributicarb)、比芬諾(pyrifenox)、嘧黴胺(pyrimethanil)、甲氧苯噠菌(pyriofenone)、百快隆(pyroquilon)、莫克草(quinoclamine)、快諾芬(quinoxyfen)、五氯硝基苯(quintozene)、虎杖紅景天提取物(Reynoutria sachalinensis extract)、氟唑環菌胺(sedaxane)、矽硫芬(silthiofam)、矽氟唑(simeconazole)、2-苯基苯氧化鈉、碳酸氫鈉、五氯酚鈉、螺環菌胺、硫磺、SYP-Z048、焦油(tar oil)、戊唑醇、特普弗洛奎(tebufloquin)、四氯硝基苯、四氟醚唑、腐絕(thiabendazole)、賽氟滅(賽氟滅)、甲基托布津(thiophanate-methyl)、得恩地(thiram)、汰敵寧(tiadinil)、甲基脫克松(tolclofos-methyl)、甲基益發靈(tolylfluanid)、三泰芬(triadimefon)、三泰隆(triadimenol)、咪唑嗪(triazoxide)、三賽唑(tricyclazole)、三得芬(tridemorph)、肱菌酯、賽福座(triflumizole)、賽福寧(triforine)、滅菌唑、維利微素(validamycin)、威利芬那雷特(valifenalate)、威利芬那(valiphenal)、免克寧(vinclozolin)、鋅乃浦、益穗(ziram)、座賽胺(zoxamide)、橄欖假絲酵母(Candida oleophila)、尖孢鐮刀菌(Fusarium oxysporum)、膠黴屬(Gliocladium spp.)、大伏革菌(Phlebiopsis gigantea)、灰綠鏈黴菌(Streptomyces griseoviridis)、木黴屬(Trichoderma spp.)、(RS)-N-(3,5-二氯苯基)-2-(甲氧基甲基)-丁二醯亞胺、1,2-二氯丙烷、1,3-二氯-1,1,3,3-四氟丙酮水合物、1-氯-2,4-二硝基苯、1-氯-2-硝基丙烷、2-(2-十七烷基-2-咪唑啉-1-基)乙醇、2,3-二氫-5-苯基-1,4-二噻英1,1,4,4-四氧化物、乙酸2-甲氧基乙基汞、2-甲氧基乙基汞氯化物、矽酸2-甲氧基乙基汞、3-(4-氯苯基)-5-甲基若丹林、4-(2-硝基丙-1-烯基)苯基硫氰酸酯、胺丙膦酸、敵菌靈(anilazine)、氧化福美雙

(azithiram)、聚硫化鋇、拜耳(Bayer)32394、麥鏽靈(benodanil)、醌肟脞(benquinox)、苯他隆(bentaluron)、苯瑪松(benzamacril)、異丁基苯瑪松、抑菌啉(benzamorf)、百蟻克(binapacryl)、硫酸雙(甲基汞)、雙(三丁基錫)氧化物、丁硫啉、鉻酸硫酸鎘鈣銅鋅(cadmium calcium copper zinc chromate sulfate)、嗎菌威(carbamorph)、CECA、克氯綜(chlobenthiazole)、雙胺靈(chloraniformethan)、克凡唑(chlorfenazole)、四氯喹噁啉(chlorquinox)、甘寶素(climbazole)、雙(3-水楊酸苯)銅、鉻酸銅鋅、硫雜靈(cufraneb)、硫酸胍銅、福美銅氯(cuprobam)、環菌胺(cyclafuramid)、氰菌靈(cypendazole)、酯菌胺(cyprofuram)、癸磷錫(decafentin)、大克隆(dichlone)、菌核利(dichlozoline)、苜氯三唑醇(diclobutrazol)、二甲噻酚(dimethirimol)、鄰敵蟻消(dinocton)、硝辛酯(dinosulfon)、硝丁酯(dinoterbon)、雙硫氧吡啉(dipyrrithione)、滅菌磷(ditalimfos)、多地辛(dodicin)、敵菌酮(drazoxolon)、EBP、ESBP、乙環唑(etaconazole)、代森硫(etem)、乙菌啉(ethirim)、敵克松(fenaminosulf)、咪菌脞(fenapanil)、種衣酯(fenitropan)、三氟苯唑(fluotrimazole)、二甲呋醯胺(furcarbanil)、呋菌唑(furconazole)、順式呋菌唑(furconazole-cis)、拌種胺(furmecyclox)、呋菌隆(furophanate)、甘啉(glyodine)、灰黃黴素(griseofulvin)、丙烯酸喹啉酯(halacrinatate)、海格立斯(Hercules)3944、己硫松(hexylthiofos)、ICIA0858、壬氧磷胺(isopamphos)、異凡二酮(isovaledione)、滅鏽胺(mebenil)、苯并威(mecarbinzid)、間氯敵菌酮(metazoxolon)、呋菌胺(methfuroxam)、甲基汞二氰二胺、噻菌胺(metsulfovax)、代森環(milneb)、糠氨酸酞、米克啉(myclozolin)、N-3,5-二氯苯基-丁二醯亞

胺、N-3-硝基苯基衣康醯亞胺、遊黴素(natamycin)、N-乙汞-4-甲苯磺醯苯胺、雙(二甲基二硫代胺基甲酸)鎳、OCH、二甲基二硫代胺基甲酸苯基汞、硝酸苯基汞、氯瘟磷(phosdiphen)、硫菌威(prothiocarb)、鹽酸硫菌威、比鏽靈(pyracarbolid)、啖菌腈(pyridinitril)、吡氯靈(pyroxychlor)、吡氧呋(pyroxyfur)、羥基喹啉基乙酮(quinacetol)、硫酸羥基喹啉基乙酮、醯菌脞(quinazamid)、喹唑(quinconazole)、吡咪唑(rabenzazole)、水楊醯苯胺(salicylanilide)、SSF-109、戊苯磺(sultropen)、福美雙聯(tecoram)、噻嗪氟(thiadifluor)、噻菌腈(thicyofen)、硫氯苯亞胺(thiochlorfenphim)、多保淨(thiophanate)、克殺蟎(thioquinox)、替系米(tioxyimid)、威菌磷(triamiphos)、嘧菌醇(triarimol)、丁三唑(triazbutil)、水楊菌胺(trichlamide)、福美甲肅(urbacid)、氰菌胺(zarilamid)及其任何組合。

【0471】 包括式I化合物之協同組合物及其用途在以下中描述：美國專利第9,526,245號(2016年12月27日頒予)、第10,045,533號(2018年8月14日頒予)、第9,532,570號(2017年1月3日頒予)、第10,045,534號(2018年8月14日頒予)、第9,538,753號(2017年1月10日頒予)及第10,051,862號(2018年8月21日頒予)，其中之每一者之全部內容在此以引用之方式併入。

【0472】 在一些實施例中，本發明之組合物進一步包括至少一種植物健康刺激劑。在一些實施例中，本發明之殺真菌混合物進一步包括至少一種植物健康刺激劑。

【0473】 在一些實施例中，植物健康刺激劑係選自由以下組成之群組：有機化合物、無機肥料或微量營養物供體、生物控制劑及接種劑。

本文所描述之組合物之用途及施用：

【0474】 本發明亦提供一種用於控制及/或預防真菌病原體攻擊植物之方法，其包括向土壤、植物、根、葉、種子、真菌之部位及/或待預防感染之部位施用本文所描述之組合物或混合物中之任一者，從而控制及/或預防真菌病原體攻擊植物。

【0475】 本發明亦提供本文所描述之組合物或混合物中之任一者，其用於控制及/或預防真菌攻擊植物。

【0476】 本發明亦提供一種本文所描述之組合物或混合物中之任一者之用途，其用於控制及/或預防真菌攻擊植物。

【0477】 本發明亦提供一種用於控制及/或預防植物及/或土壤真菌疾病之方法，其包括向土壤、植物、根、葉、種子、真菌之部位及/或待預防感染之部位施用本文所描述之組合物或混合物中之任一者，從而控制及/或預防植物及/或土壤真菌疾病。

【0478】 本發明亦提供本文所描述之組合物或混合物中之任一者，其用於控制及/或預防植物及/或土壤真菌疾病。

【0479】 本發明亦提供一種本文所描述之組合物或混合物中之任一者之用途，其用於控制及/或預防植物及/或土壤真菌疾病。

【0480】 在一些實施例中，將組合物或混合物施用於植物之一部分、靠近植物之區域、與植物接觸之土壤、靠近植物之土壤、靠近植物之任何表面、與植物接觸之任何表面、種子及/或農業中使用之設備。

【0481】 在一些實施例中，以在5 g/ha至150 g/ha式I化合物之範圍內之量，施用組合物或混合物。在一些實施例中，以6.25 g/ha式I化合物之量，施用組合物或混合物。在一些實施例中，以在10 g/ha式I化合物之

量，施用組合物或混合物。在一些實施例中，以12.5 g/ha式I化合物之量，施用組合物或混合物。在一些實施例中，以20 g/ha式I化合物之量，施用組合物或混合物。在一些實施例中，以75 g/ha式I化合物之量，施用組合物或混合物。在一些實施例中，以100 g/ha式I化合物之量，施用組合物或混合物。在一些實施例中，以125 g/ha式I化合物之量，施用組合物或混合物。

【0482】 在一些實施例中，在種植時施用組合物或混合物。

【0483】 在一些實施例中，在種植後1至60天，施用組合物或混合物。

【0484】 在一些實施例中，在種植後1至9個月，施用組合物或混合物。

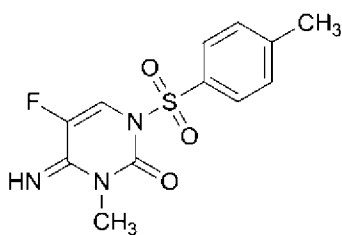
【0485】 在一些實施例中，在生長季節期間，施用組合物或混合物一次。

【0486】 在一些實施例中，在生長季節期間，施用組合物或混合物至少一次。

【0487】 在一些實施例中，在生長季節期間，施用組合物或混合物兩次或更多次。

【0488】 在一些實施例中，以葉面種子處理及/或土壤施用形式，施用組合物或混合物。

【0489】 本發明亦提供一種控制及/或預防真菌病原體攻擊植物之方法，其包括向土壤、植物、根、葉、種子、真菌之部位及/或待預防感染之部位施用殺真菌有效量之具有式(I)之化合物：



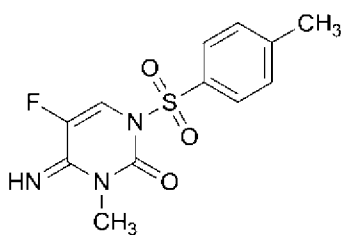
式I

;

及至少一種佐劑，從而控制及/或預防真菌病原體攻擊植物，其中佐劑係選自由以下組成之群組：

- (i) 聚氧化烯烷基醚；
- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；
- (iv) 乙烯吡咯啉酮及其衍生物；及
- (v) 糖基界面活性劑。

【0490】 本發明亦提供一種控制及/或預防植物及/或土壤真菌疾病之方法，其包括向土壤、植物、根、葉、種子、真菌之部位及/或待預防感染之部位施用殺真菌有效量之具有式(I)之化合物：



式I

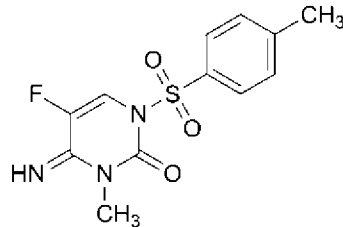
;

及至少一種佐劑，從而控制及/或預防植物及/或土壤真菌疾病，其中佐劑係選自由以下組成之群組：

- (i) 聚氧化烯烷基醚；
- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；

- (iv) 乙炔吡咯啉酮及其衍生物；及
- (v) 糖基界面活性劑。

【0491】 本發明提供一種用於改良一式I化合物針對真菌病原體之生物活性之方法，所述方法包括在至少一種佐劑的存在下施用式I化合物：



式I

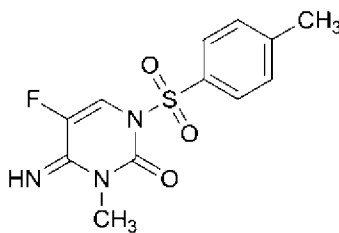
其中佐劑係選自由以下組成之群組：

- (i) 聚氧化烯烷基醚；
- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；
- (iv) 乙炔吡咯啉酮及其衍生物；及
- (v) 糖基界面活性劑

從而改良所述式I化合物之生物活性。

【0492】 在一些實施例中，在存在至少兩種佐劑之情況下，施用式I化合物。

【0493】 本發明亦提供一種具有式(I)之化合物與至少一種佐劑之用途：



式I

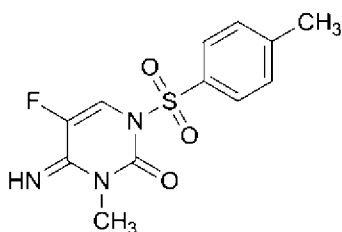
；

所述至少一種佐劑選自由以下組成之群組：

- (i) 聚氧化烯烷基醚；
- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；
- (iv) 乙烯吡咯啉酮及其衍生物；及
- (v) 糖基界面活性劑，

其用於(a)控制及/或預防真菌病原體攻擊一植物及/或(b)控制及/或預防植物及/或土壤真菌疾病。

【0494】 本發明亦提供一種具有式(I)之化合物：



式I ;

及選自由以下組成之群組之至少一種佐劑：

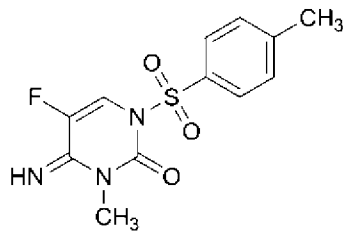
- (i) 聚氧化烯烷基醚；
- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；
- (iv) 乙烯吡咯啉酮及其衍生物；及
- (v) 糖基界面活性劑，

其用於(a)控制及/或預防真菌病原體攻擊植物及/或(b)控制及/或預防植物及/或土壤真菌疾病。

【0495】 本發明提供一種選自由以下組成之群組之至少一種佐劑之用途：

- (i) 聚氧化烯烷基醚；
- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；
- (iv) 乙烯吡咯啉酮及其衍生物；及
- (v) 糖基界面活性劑

其用於改良所述式(I)化合物之生物活性：

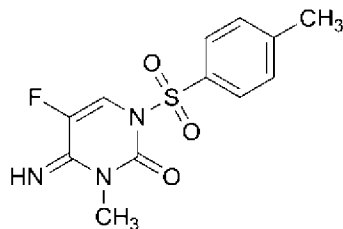


式I

【0496】 本發明提供一種選自由以下組成之群組之佐劑：

- (i) 聚氧化烯烷基醚；
- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；
- (iv) 乙烯吡咯啉酮及其衍生物；及
- (v) 糖基界面活性劑

其用於改良所述式(I)化合物之生物活性：



式I

【0497】 上文描述較佳的佐劑。

【0498】 在一些實施例中，同時施用式I化合物及佐劑。在一些實施

例中，依序施用式I化合物及佐劑。

【0499】 在一些實施例中，分開施用式I化合物及佐劑。在一些實施例中，一起施用式I化合物及佐劑。在一些實施例中，以槽式混合物形式一起施用式I化合物及佐劑。在一些實施例中，式I化合物及佐劑經調配為單一組合物。在一些實施例中，與式I化合物一起調配於組合物中之佐劑為內置式佐劑。與式I化合物槽式混合或分開施用(例如經由分開噴霧)之佐劑為附加式佐劑。

【0500】 在一些實施例中，施用兩種或更多種佐劑，其中佐劑中之至少一者為內置式佐劑，且佐劑中之至少一者為附加式佐劑。

【0501】 在一些實施例中，以在5 g/ha至150 g/ha之範圍內之量，施用式I化合物。在一些實施例中，以10 g/ha之量，施用式I化合物。

【0502】 可施用式I化合物及包括式I化合物之組合物與混合物，以控制及/或預防多種真菌病原體及與其相關的疾病。在一些實施例中，真菌病原體為以下中之一者：小麥葉斑病(禾生球腔菌(*Mycosphaerella graminicola*))；無性型：小麥葉枯病菌(*Zymoseptoria tritici*)、小麥褐銹病(小麥葉鏽菌(*Puccinia triticina*))、條銹病(小麥條形柄鏽菌屬(*Puccinia striiformis f. sp. tritici*))、蘋果瘡痂病(蘋果黑星病菌(*Venturia inaequalis*))、玉米黑粉病(玉米黑粉菌(*Ustilago maydis*))、葡萄藤白粉病(葡萄白粉病菌(*Uncinula necator*))、大麥日燒病(大麥雲紋病菌(*Rhynchosporium secalis*))、稻瘟病(稻瘟菌(*Magnaporthe grisea*))、大豆銹病(大豆鏽菌(*Phakopsora pachyrhizi*))、小麥穎枯病(穎枯殼小球腔菌(*Leptosphaeria nodorum*))、小麥白粉病(小麥白粉病菌(*Blumeria graminis f. sp. tritici*))、大麥白粉病(大麥白粉病菌(*Blumeria graminis f.*

sp. hordei))、葫蘆科白粉病(二孢白粉菌(*Erysiphe cichoracearum*))、葫蘆科炭疽病(瓜類小叢殼(*Glomerella lagenarium*))、甜菜葉斑病(甜菜尾孢菌(*Cercospora beticola*))、番茄早疫病(番茄早疫病菌(*Alternaria solani*))及大麥網斑病(大麥網斑病菌(*Pyrenophora teres*))。

【0503】 在一些實施例中，真菌病原體為以下中之一者：小麥葉斑病(禾生球腔菌(*Mycosphaerella graminicola*))；無性型：小麥葉枯病菌(*Zymoseptoria tritici*)、小麥褐銹病(小麥葉鏽菌(*Puccinia triticina*))、條銹病(小麥條形柄鏽菌屬(*Puccinia striiformis f. sp. tritici*))、蘋果瘡痂病(蘋果黑星病菌(*Venturia inaequalis*))、玉米黑粉病(玉米黑粉菌(*Ustilago maydis*))、葡萄藤白粉病(葡萄白粉病菌(*Uncinula necator*))、大麥日燒病(大麥雲紋病菌(*Rhynchosporium secalis*))、稻瘟病(稻瘟菌(*Magnaporthe grisea*))、大豆銹病(大豆鏽菌(*Phakopsora pachyrhizi*))、小麥穎枯病(穎枯殼小球腔菌(*Leptosphaeria nodorum*))、小麥白粉病(小麥白粉病菌(*Blumeria graminis f. sp. tritici*))、大麥白粉病(大麥白粉病菌(*Blumeria graminis f. sp. hordei*))、葫蘆科白粉病(二孢白粉菌(*Erysiphe cichoracearum*))、葫蘆科炭疽病(瓜類小叢殼(*Glomerella lagenarium*))、甜菜葉斑病(甜菜尾孢菌(*Cercospora beticola*))、番茄早疫病(番茄早疫病菌(*Alternaria solani*))及大麥網斑病(大麥網斑病菌(*Pyrenophora teres*))。

【0504】 在一些實施例中，真菌病原體為小麥葉枯病菌。

【0505】 在一些實施例中，植物或土壤疾病為以下中之一者：葉斑病、褐銹病、黃銹病、白粉病、雲紋斑病、網斑病、微座孢斑病(*Microdochium majus*)、核盤菌病、霜黴病、疫黴病(*Phytophthora*)、甜

菜葉斑病、柱隔孢病(Ramularia)、ASR。黑條葉斑病。

【0506】 本發明之方法係指任何作物植物，包含(但不限於)單子葉植物，諸如甘蔗穀物、稻米、玉米(maize/corn)及/或；或雙子葉植物作物，諸如甜菜(諸如糖用甜菜或飼用甜菜)；水果(諸如梨果、核果或軟果，例如蘋果、梨、李子、桃、杏、櫻桃、草莓、覆盆子或黑莓)；豆科植物(諸如菜豆、扁豆、豌豆或大豆)；油科植物(諸如油菜、芥菜、罌粟、橄欖、向日葵、椰子、蓖麻油植物、可可豆或花生)；黃瓜植物(諸如西葫蘆、黃瓜或甜瓜)；纖維植物(諸如棉花、亞麻、大麻或黃麻)；柑橘類水果(諸如橙子、檸檬、葡萄柚或蜜橘)；蔬菜(諸如菠菜、萵苣、甘藍、胡蘿蔔、蕃茄、馬鈴薯、葫蘆或辣椒)；樟科(諸如鱷梨、肉桂或樟腦)；菸草；堅果；咖啡；茶；藤本植物；蛇麻子；榴蓮；香蕉；天然橡膠植物；及觀賞性植物(諸如花卉、灌木、闊葉樹或常青樹，例如針葉樹)。

【0507】 在一些實施例中，植物為單子葉植物，更佳地穀物。在一具體實施例中，穀物作物為小麥。在另一具體實施例中，穀物作物為黑小麥。在另一具體實施例中，穀物作物為黑麥。在另一具體實施例中，穀物作物為燕麥。在又一實施例中，穀物作物為大麥。在另一實施例中，作物植物為稻米植物。在再一實施例中，作物植物為甘蔗植物。在又一實施例中，作物植物為玉米植物。

【0508】 在另一實施例中，作物植物為雙子葉植物。

【0509】 在一個實施例中，作物植物為油菜植物。

【0510】 如美國專利申請公開案第2018-0000082號(2018年1月4日公開)中所描述，式I化合物及其組合物亦可用作種子處理以預防或控制植

物病原性真菌，所述文獻之全部內容在此以引用之方式併入本申請中。

【0511】 本發明亦提供一種用於控制或預防真菌攻擊植物或保護植物免於真菌攻擊之方法，所述方法包括向適合於生產植物之種子施用本文所揭示之組合物或混合物中之任一者。

【0512】 本發明亦提供一種處理植物種子或幼苗以產生對真菌攻擊具有抗性之植物之方法，所述方法包括向植物種子或幼苗施用本文所揭示之組合物或混合物中之任一者。

【0513】 本發明亦提供一種保護植物免於真菌攻擊之方法，所述方法包括向幼苗環境施用本文所揭示之組合物或混合物中之任一者。

【0514】 本發明亦提供一種對真菌攻擊具有抗性之植物，其中植物種子用本文所揭示之組合物或混合物中之任一者處理。

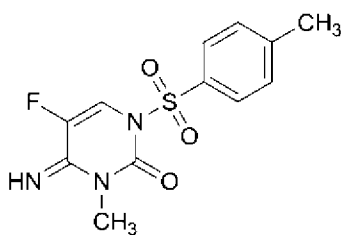
【0515】 本發明亦提供一種適合於產生對真菌攻擊具有抗性之植物之植物種子或幼苗，其中植物種子或幼苗用本文所揭示之組合物或混合物中之任一者處理。

【0516】 本發明亦提供一種封裝，其包括本文所揭示之組合物或混合物中之任一者。

【0517】 本發明亦提供一種本文所揭示之混合物中之任一者之用途，其用於製造殺真菌組合物。本發明亦提供一種本文所揭示之混合物中之任一者之用途，其用於製造本文所揭示之組合物中之任一者。

增加包括式I化合物之液體組合物之穩定性之方法：

【0518】 本發明亦提供一種用於增加液體組合物之穩定性之方法，所述液體組合物包括式I化合物：



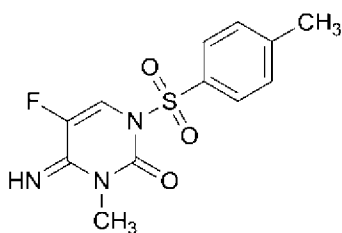
式I

;

及一液體載體，其中所述方法包括：

- a) 選擇液體載體，其中式I化合物在液體載體中之溶解度小於5000 ppm，
- b) 將組合物之pH值維持在5至7.5之範圍內，
- c) 按組合物之總重量計，將組合物之含水量維持至小於0.5重量%，
- d) 添加(i)對於液體組合物具有晶體成長抑制特性之至少一種穩定化界面活性劑，或(ii)對於液體組合物具有晶體成長抑制特性之穩定化系統，及/或
- e) 將組合物調配為具有至少500 cP之黏度，從而增加包括式I化合物之組合物之穩定性。

【0519】 本發明亦提供一種用於增加液體組合物之穩定性之方法，所述液體組合物包括式I化合物：



式I

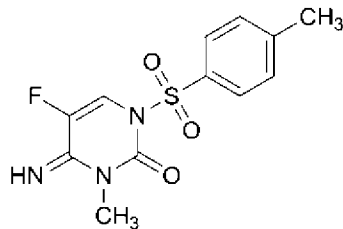
;

及液體載體，其中所述方法包括選擇液體載體，其中式I化合物在液體載體中之溶解度小於5000 ppm。

【0520】 在一些實施例中，式I化合物在液體載體中之溶解度小於

1000 ppm。在一些實施例中，式I化合物在液體載體中之溶解度為約200 ppm。在一些實施例中，式I化合物在液體載體中之溶解度為約80 ppm。

【0521】本發明亦提供一種用於增加液體組合物之穩定性之方法，所述液體組合物包括式I化合物：



式I ;

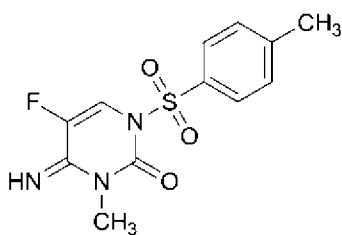
及液體載體，其中所述方法包括將組合物之pH值維持在5至7.5之範圍內。

【0522】在一些實施例中，在不進一步稀釋或潤濕之情況下，量測組合物之pH。在一些實施例中，在用水稀釋或潤濕之後，量測pH。

【0523】在一些實施例中，組合物之pH為約5；在一些實施例中，組合物之pH為約5.5；在一些實施例中，組合物之pH為約5.8；在一些實施例中，組合物之pH為約6；在一些實施例中，組合物之pH為約6.5；在一些實施例中，組合物之pH為約7。在一些實施例中，組合物之pH為約7.5。

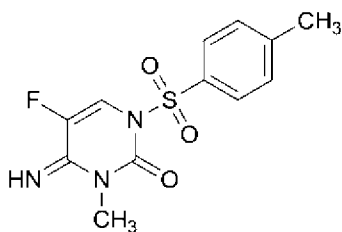
【0524】在一些實施例中，所述方法包括向液體組合物中添加pH調節劑。

【0525】本發明亦提供一種pH調節劑之用途，其用於增加包括式I化合物之水性懸浮液濃縮物(SC)組合物之穩定性：



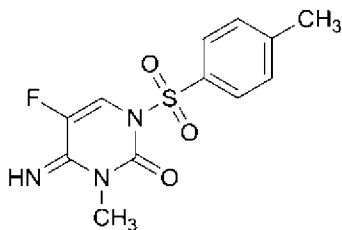
式I

【0526】 本發明亦提供一種pH調節劑之用途，其用於增加包括式I化合物之水性懸乳劑(SE)組合物之穩定性：



式I

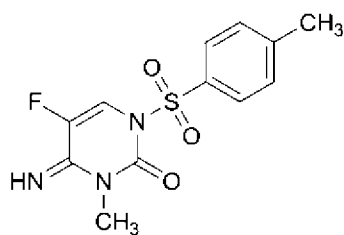
【0527】 本發明亦提供一種用於增加液體組合物之穩定性之方法，所述液體組合物包括式I化合物：



式I

及液體載體，其中按組合物之總重量計，所述方法包括將組合物之含水量維持至小於0.5重量%。

【0528】 本發明亦提供一種用於增加液體組合物之穩定性之方法，所述液體組合物包括式I化合物：



式I

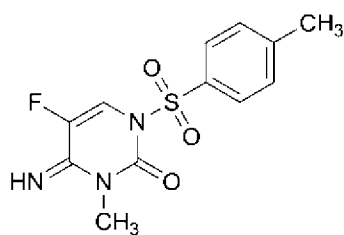
;

及液體載體，其中所述方法包括添加(i)對於液體組合物具有晶體成長抑制特性之至少一種穩定化界面活性劑，或(ii)對於液體組合物具有晶體成長抑制特性之穩定化系統。

【0529】 在一些實施例中，穩定化界面活性劑為聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物。在一些實施例中，穩定化界面活性劑為聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物。

【0530】 在一些實施例中，添加至少兩種穩定化界面活性劑。在一些實施例中，所述至少兩種穩定化界面活性劑包括聚氧化烯聚芳基醚之至少一種非離子性衍生物及聚氧化烯聚芳基醚之至少一種陰離子性衍生物。

【0531】 本發明亦提供一種具有聚氧化烯聚芳基醚之結構之至少一種穩定化界面活性劑之用途，其用於控制式I化合物之溶解度及/或降解：



式I

。

【0532】 在一些實施例中，具有聚氧化烯聚芳基醚之結構之穩定化界面活性劑為聚氧化烯聚芳基醚之非離子性衍生物。在一些實施例中，具有聚氧化烯聚芳基醚之結構之穩定化界面活性劑為聚氧化烯聚芳基醚之陰離子性衍生物。

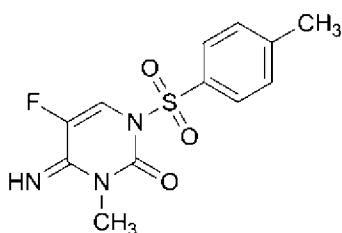
【0533】 在一些實施例中，所述方法進一步包括選擇液體載體，其中式I化合物在液體載體中之溶解度小於5000 ppm。

【0534】 在一些實施例中，所述方法進一步包括將組合物之pH值維持在5至7.5之範圍內。

【0535】 在一些實施例中，按組合物之總重量計，所述方法進一步包括將組合物之含水量維持至小於0.5重量%。

【0536】 在一些實施例中，所述方法進一步包括添加(i)對於液體組合物具有晶體成長抑制特性之至少一種穩定化界面活性劑，或(ii)對於液體組合物具有晶體成長抑制特性之穩定化系統。

【0537】 本發明亦提供一種用於增加液體組合物之穩定性之方法，所述液體組合物包括式I化合物：



式I ;

及液體載體，其中所述方法包括將組合物調配為具有至少500 cP之黏度。

【0538】 在一些實施例中，穩定的液體組合物為懸浮液濃縮物(SC)組合物。

【0539】 在一些實施例中，穩定的組合物為懸乳劑(SE)組合物。

【0540】 在一些實施例中，穩定的液體組合物為油分散液(OD)組合物。

【0541】 在一些實施例中，穩定的液體組合物為可乳化濃縮物(EC)

組合物。

【0542】 在一些實施例中，在施用之前，將混合物或組合物稀釋。在一些實施例中，用水稀釋混合物或組合物。施用經稀釋的混合物或組合物之速率視在稀釋之前混合物或組合物中之活性成分之濃度而定。一般而言，以約5 L/ha至約120 L/ha之速率，施用經稀釋的混合物或組合物。

製備包括式I化合物之組合物之方法

【0543】 本發明提供一種用於製備本文所揭示之懸浮液濃縮物(SC)組合物之方法，所述方法包括以下步驟：

- (1) 將農業上可接受之惰性添加劑與水性液體載體混合，得到預混合物；
- (2) 向步驟(1)中獲得之預混合物中添加式I化合物，得到混合物；及
- (3) 研磨步驟(2)所得混合物，得到所需組合物。

【0544】 在一些實施例中，所述方法包括在研磨混合物之前向步驟(2)之混合物中添加額外添加劑。

本發明提供一種用於製備本文所揭示之懸乳劑(SE)組合物之方法，所述方法包括以下步驟：

- (1) 將農業上可接受之惰性添加劑與水性液體載體混合，得到預混合物；
- (2) 向步驟(1)中獲得之所述預混合物中添加所述式I化合物及至少一種佐劑，得到一混合物；及
- (3) 研磨步驟(2)所得混合物，得到所需組合物。

【0545】 在一些實施例中，步驟(1)包括添加非水性液體載體。在一些實施例中，步驟(2)包括添加非水性液體載體。在一些實施例中，步驟

(2)中所添加之佐劑為非水性液體載體。

本發明提供一種用於製備本文所揭示之油分散液(OD)組合物之方法，所述方法包括以下步驟：

(1) 將農業上可接受之惰性添加劑與非水性液體載體混合，得到預混合物；

(2) 向步驟(1)中獲得之預混合物中添加式I化合物，得到混合物；及

(3) 研磨步驟(2)所得混合物，得到所需組合物。

【0546】 本發明提供一種用於製備本文所揭示之可乳化濃縮物(EC)組合物之方法，所述方法包括以下步驟：

(1) 將農業上可接受之惰性添加劑與非水性液體載體混合，得到預混合物；

(2) 向步驟(1)中獲得之預混合物中添加式I化合物，得到混合物；及

(3) 過濾步驟(2)之溶液，得到所需組合物。

【0547】 本文中所揭示之各實施例預期適用於其他所揭示之實施例中之各者。因此，本文所描述之各種要素之所有組合均在本發明之範疇內。另外，當提供清單時，清單應視為清單之任一成員之揭示。

【0548】 參考以下實驗細節將更好地理解本發明，但本領域中熟習此項技術者將易於瞭解，詳述之特定實驗僅為本發明之例示，其在其後申請專利範圍中被更充分地描述。藉由以下實例說明本發明，但不限於此。

實驗部分

【0549】 可如WO2015/103144及WO2015/103142中所描述，來製備式I化合物。

【0550】 歸因於化合物之高敏感性，製備包括式I化合物之穩定的組

合物係具有挑戰性的。進行多種嘗試來使組合物穩定。一些結果於下文描述。

【0551】 將式I化合物與佐劑合併，作為槽式混合物及/或內置式組合物。測試不同類型之佐劑與不同組合物。

【0552】 所測試之佐劑為聚乙烯吡咯啉酮(PVP)、乙烯吡咯啉酮與乙酸乙烯酯嵌段共聚物(VP/VA)、矽氧烷聚氧化烯共聚物 (Silwet® L-077)、乙氧基化十三烷醇13/9(Trycol®)、烷氧基化醇(Agnique® BP420)及脂肪酸甲酯(Agnique® ME 18 RDF)。

實例1：無佐劑之450 SC組合物

【0553】 如下製備含有450 g/L式I化合物及無佐劑之懸浮液濃縮物(SC)調配物：

步驟I：農業上可接受之惰性添加劑預混合物之製備

【0554】 將軟水及Van Gel® B饋入容器中，且混合(高剪切)以形成溶液。將容器之內容物加熱至60°C。將SOPROPHOR® TS/54(TSP 54)加熱至50-60°C，且逐漸添加至容器中。隨後，向均勻溶液中添加Supragil® WP、Soprophor® 3D33、KH₂PO₄、Na₂HPO₄及SAG 1572。

步驟II：式I化合物之製備

【0555】 向內部具有界面活性劑之預混合物中添加式I化合物(40% w/w)，且在珠磨機(0.8-1.2 mm珠粒)中研磨懸浮液直至粒徑分佈達到d₉₀<5 μm。將經研磨之懸浮液自反應器排至新容器中。

步驟III：組合物之完結

【0556】 將丙二醇添加至經研磨之懸浮液中，且混合，直至獲得均一懸浮液。在混合同時，向懸浮液中添加軟水及AgRH 23 2%溶液，直至

黏度達到1600-2200 cP。繼續混合，直至獲得均勻溶液。根據CIPAC方法MT 192，藉由黏度計來量測黏度。

【0557】組合物概述於表1中。

表1：具有式I化合物且不含佐劑之450 SC組合物

| 成分商標名 | 化學名稱及CAS號 | 用於1000 L(kg)之量 |
|---|--|---------------------|
| 式I化合物技術含量， 100%之ADAMA Makhteshim LTD. | 5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-[4-甲基苯基]磺醯基]-3,4-二氫嘓啶-2(1H)-酮 CAS號N/A | 450 kg(469 kg，佔96%) |
| Solvay之Supragil® WP， 或 OXITENO之SURFOM® HRB | 二異丙基萘磺酸鈉 CAS號1322-93-6 | 5.9 Kg |
| Solvay之Soprophor® 3 D 33 | 聚芳基苯基醚磷酸酯 CAS號90093-37-1，99734-09-5， 7664-38-2 | 47.0 kg |
| Clariant之Emulsogen® TS 540或Solvay之 SOPROPHOR® TS/54 | 三苯乙炔基苯酚-聚乙二醇醚 CAS號70559-25-0(Clariant) CAS號104376-75-2(Solvay) | 17.5 Kg |
| Momentive Performance Materials GmbH之SAG™ 1572 | 聚二甲基矽氧烷乳液 CAS號N/A，56-81-5(甘油) | 2.0 Kg |
| INEOS OXIDE之MPG- MPG USP或 SHELL EASTERN | 1,2-丙二醇 CAS號57-55-6 | 23.5 Kg |

| | | |
|---|---|-----------------------|
| CHEMICALS之MPG工業 TG或 DOW之工業級丙二醇 | | |
| Rotem Amfert Negev Ltd. 之MKP(磷酸氫二鉀)， | KH_2PO_4 (正磷酸二氫鉀) CAS號7778-77-0 | 1.7 Kg |
| Haifa Chemicals Ltd.之無 水磷酸二鈉 | Na_2HPO_4 (無水磷酸二鈉) CAS號7558-79-4 | 6.9 Kg |
| Vanderbilt minerals,LLC.之 Van Gel® B | 矽酸鎂鋁，膨潤石黏土； CAS號12199-37-0 | 5.9 kg |
| Ametech之AgRH 23 | 三仙膠 CAS號11138-66-2 | 2.8 Kg |
| 軟水 | | 補足至1000 L(約616 kg) |

外觀：灰白色均勻懸浮液

密度，g/ml：1.15-1.20

穩定性結果：

【0558】 在包含CIPAC條件之各種條件下，測試實例1之組合物之物理及化學穩定性。穩定性結果概述於表2中。

表2：實例1之組合物之穩定性結果

| | 開始 | 室內 | 烘箱54°C |
|--------------------------|-----------------|----------|----------|
| 外觀 | 灰白色均勻懸浮液 | 灰白色均勻懸浮液 | 灰白色均勻懸浮液 |
| 式I化合物之濃度 | 40.80% | 40.4% | 40.2% |
| 密度，g/ml | 1.18 | 1.21 | -- |
| pH | 6.3 | 6.0 | 6.6 |
| 黏度，在12 rpm下 sp.62(cP) | 1790(在1天 之後) | 1000 | -- |
| D ₉₀ | 6.326 | 6.326 | 10.14 |
| 起泡0.2% | -- | 10ml | 10ml |
| 起泡1% | -- | 25ml | 25ml |
| WSR(45 u/75u)10% | 好 | 好 | 好 |
| 懸浮性，0.2 % | -- | 101 | 99.7 |
| 懸浮性，1% | -- | 102.8 | 101.6 |

【0559】 將實例1之組合物儲存在54°C下2週。未觀測到晶體生長。量測式I化合物之濃度，且濃度高於95%。

實例2：具有乙烯吡咯啉酮與乙酸乙烯酯共聚物(VA/VP)之混合物之450 SC組合物

【0560】 如下製備含有450 g/L式I化合物及1種內置式佐劑(VP/VA)之懸浮液濃縮物(SC)調配物：

步驟I：農業上可接受之惰性添加劑預混合物之製備

【0561】 將軟水及Van Gel®B饋入容器中，且混合(高剪切)以形成溶液。將容器之內容物加熱至60°C。將SOPROPHOR® TS/54(TSP 54)加熱至50-60°C，且逐漸添加至容器中。向均勻溶液中添加Supragil® WP、Soprophor® 3D33、KH₂PO₄、Na₂HPO₄及SAG 1572。

步驟II：式I化合物之製備

【0562】向內部具有界面活性劑之預混合物中添加式I化合物(40% w/w)。在珠磨機(0.8-1.2 mm珠粒)中研磨懸浮液，直至粒徑達到 $d_{90} < 5 \mu\text{m}$ 。將經研磨之懸浮液自反應器排至新容器中。

步驟III：組合物之完結

【0563】將丙二醇及VP/VA添加至經研磨之懸浮液中，直至獲得均一懸浮液。在混合同時，向懸浮液中添加軟水及AgRH 23 2%溶液，直至黏度達到1600-2200 cP。繼續混合，直至獲得均勻溶液。根據CIPAC方法MT 192，藉由黏度計來量測黏度。

【0564】組合物概述於表3中。

表3：具有VP/VA之450 SC組合物

| 成分商標名 | 化學名稱及CAS | 用於1000 L(kg)之量 |
|---|---|---------------------|
| 式I化合物技術含量， 100%之ADAMA Makhteshim LTD. | 5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-[4-甲基苯基]磺醯基]-3,4-二氫嘧啶-2(1H)-酮 CAS號N/A | 450 kg(469 kg，佔96%) |
| Solvay之Supragil® WP，或 OXITENO之SURFOM HRB | 二異丙基萘磺酸鈉 CAS號1322-93-6 | 5.9 Kg |
| Solvay之Soprophor® 3 D 33 | 聚芳基苯基醚磷酸酯 CAS號90093-37-1，99734-09-5， 7664-38-2 | 47.0 kg |
| Clariant之Emulsogen® TS 540或 Solvay之 SOPROPHOR® TS/54 | 三苯乙烯基苯酚-聚乙二醇醚 CAS號70559-25-0(Clariant)， 104376-75-2(Solvay) | 17.5 Kg |

| | | |
|--|---|--------------------|
| Ashland之Agrimer™ VA 6或 BASF之Sokalan® VA 64 P | 乙烯吡咯啉酮與乙酸乙烯酯共聚物之混合物 CAS號25086-89-9 | 17.5 Kg |
| Momentive Performance Materials GmbH之 SAG™ 1572 | 聚二甲基矽氧烷乳液 CAS號N/A，56-81-5(甘油) | 2.0 Kg |
| INEOS OXIDE之MPG-MPG USP或 SHELL EASTERN CHEMICALS之MPG工業TG或 DOW之工業級丙二醇 | 1,2-丙二醇 CAS號57-55-6 | 23.5 Kg |
| Rotem Amfert Negev Ltd.之MKP(磷酸氫二鉀)， | KH_2PO_4 (正磷酸二氫鉀) CAS號7778-77-0 | 1.7 Kg |
| Haifa Chemicals Ltd.之無水磷酸二鈉 | Na_2HPO_4 (無水磷酸二鈉) CAS號7558-79-4 | 6.9 Kg |
| Vanderbilt minerals,LLC.之Van Gel® B | 矽酸鎂鋁，膨潤石黏土； CAS號12199-37-0 | 5.9 kg |
| Ametech之AgRH 23 | 三仙膠 CAS號11138-66-2 | 2.8 Kg |
| 軟水 | | 補足至1000 L(約599 kg) |

外觀：灰白色均勻懸浮液

密度，g/ml：1.15-1.20

穩定性結果：

【0565】將實例2之組合物儲存在54°C下2週。未觀測到晶體生長。量測式I化合物之濃度，且濃度略微小於95%。

實例3：具有乙烯吡咯啉酮/乙酸乙烯酯共聚物與Silwet® L-077之混

合物之450 SC及660 SC組合物

【0566】 如下製備懸浮液濃縮物(SC)調配物，一種含有450 g/L式I化合物及兩種內置式佐劑(VP/VA及Silwet® L-077)，且另一種含有660 g/L式I化合物及兩種內置式佐劑(VP/VA及Silwet® L-077)：

步驟I：農業上可接受之惰性添加劑預混合物之製備

【0567】 將軟水(及Van Gel®B，對於450 SC組合物)饋入容器中，且混合(高剪切)以形成溶液。將容器之內容物加熱至60°C。將SOPROPHOR® TS/54(TSP 54)加熱至50-60°C，且逐漸添加至容器中。向均勻溶液中添加Supragil® WP、Soprophor® 3D33、KH₂PO₄、Na₂HPO₄及SAG 1572。

步驟II：式I化合物之製備

【0568】 向內部具有界面活性劑之預混合物中添加式I化合物(40% w/w)。在珠磨機(0.8-1.2 mm珠粒)中研磨懸浮液，直至粒徑達到d₉₀<5 μm。將經研磨之懸浮液自反應器排至新容器中。

步驟III：組合物之完結

【0569】 將丙二醇及Silwet® L-077添加至經研磨之懸浮液中，直至獲得均一懸浮液。在混合同時，向懸浮液中添加軟水及AgRH 23 2%溶液，直至黏度達到1600-2200 cP。繼續混合，直至獲得均勻溶液。根據CIPAC方法MT 192，藉由黏度計來量測黏度。

450 SC組合物概述於表4中，且660 SC組合物概述於表5中。

表4：具有VP/VA及Silwet® L-077之450 SC組合物

| 成分商標名 | 化學名稱及CAS | 用於1000 L(kg)之量 |
|---|---|------------------------|
| 式I化合物技術含量， 100%之ADAMA Makhteshim LTD. | 5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-[4-甲基苯 基)磺醯基]-3,4-二氫嘧啶-2(1H)-酮 CAS號N/A | 450 kg(469 kg，佔96%) |
| Solvay之Supragil® WP，或 OXITENO之 SURFOM® HRB | 二異丙基萘磺酸鈉 CAS號1322-93-6 | 5.9 Kg |
| Solvay之Soprophor® 3 D 33 | 聚芳基苯基醚磷酸酯 CAS號90093-37-1，99734-09-5， 7664-38-2 | 47.0 kg |
| Clariant之Emulsogen® TS 540或 Solvay之 SOPROPHOR® TS/54 | 三苯乙烯基苯酚-聚乙二醇醚 CAS號70559-25-0(Clariant)， 104376-75-2(Solvay) | 17.5 Kg |
| Ashland之Agrimer™ VA 6或 BASF之Sokalan® VA 64 P | 乙烯吡咯啉酮與乙酸乙烯酯共聚物 之混合物 CAS號25086-89-9 | 17.5 Kg |
| Momentive Performance Materials GmbH之 SAG™ 1572 | 聚二甲基矽氧烷乳液 CAS號N/A，56-81-5(甘油) | 2.0 Kg |
| Momentive之Silwet® L- 077 | 經聚氧化烯改質之七甲基三矽氧 烷，CAS號 27306-78-1 | 9.0 kg |
| INEOS OXIDE之MPG- MPG USP或 SHELL EASTERN CHEMICALS之MPG工 | 1,2-丙二醇 CAS號57-55-6 | 23.5 Kg |

| | | |
|---|---|-----------------------|
| 業TG或 DOW之工業級丙二醇 | | |
| Rotem Amfert Negev Ltd.之MKP(磷酸氫二 鉀) , | KH_2PO_4 (正磷酸二氫鉀) CAS號7778-77-0 | 1.7 Kg |
| Haifa Chemicals Ltd.之 無水磷酸二鈉 | Na_2HPO_4 (無水磷酸二鈉) CAS號7558-79-4 | 6.9 Kg |
| Vanderbilt minerals,LLC. 之Van Gel® B | 矽酸鎂鋁，膨潤石黏土； CAS號12199-37-0 | 5.9 kg |
| Ametech之AgRH 23 | 三仙膠 CAS號11138-66-2 | 2.8 Kg |
| 軟水 | | 補足至1000 L(約590 kg) |

外觀：灰白色均勻懸浮液

密度，g/ml：1.15-1.20

穩定性結果：

【0570】 將表4之組合物儲存在54°C下2週。未觀測到晶體生長。量測式I化合物之濃度，且濃度略微小於95%。

表5：具有VP/VA及Silwet® L-077之660 SC組合物

| 成分商標名 | 化學名稱及CAS | 用於1000 L(kg)之量 |
|--|---|--------------------------|
| 式I化合物技術含量，100%之 ADAMA Makhteshim LTD. | 5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-[4-甲 基苯基)磺醯基]-3,4-二氫嘧啶- 2(1H)-酮 CAS號N/A | 660 kg(687.5 kg，佔96%) |
| Solvay之Supragil® WP，或 OXITENO之SURFOM® HRB | 二異丙基萘磺酸鈉 CAS號1322-93-6 | 10.0 Kg |

| | | |
|--|---|--------------------|
| Solvay之Soprophor® 3 D 33 | 聚芳基苯基醚磷酸酯 CAS號90093-37-1，99734-09-5，7664-38-2 | 56.25 kg |
| Clariant之Emulsogen® TS 540 或 Solvay之SOPROPHOR® TS/54 | 三苯乙炔基苯酚-聚乙二醇醚 CAS號70559-25-0(Clariant)， 104376-75-2(Solvay) | 21.25 Kg |
| Ashland之Agrimer™ VA 6或 BASF之Sokalan® VA 64 P | 乙烯吡咯啉酮與乙酸乙烯酯共聚物之混合物 CAS號25086-89-9 | 13.5 Kg |
| Momentive Performance Materials GmbH之SAG™ 1572 | 聚二甲基矽氧烷乳液 CAS號N/A，56-81-5(甘油) | 5.0 Kg |
| Momentive之Silwet® L-077 | 經聚氧化烯改質之七甲基三矽氧烷，CAS號 27306-78-1 | 9.5 kg |
| INEOS OXIDE之MPG-MPG USP或 SHELL EASTERN CHEMICALS之MPG工業TG 或 DOW之工業級丙二醇 | 1,2-丙二醇 CAS號57-55-6 | 37.5 Kg |
| Rotem Amfert Negev Ltd.之MKP(磷酸氫二鉀)， | KH_2PO_4 (正磷酸二氫鉀) CAS號7778-77-0 | 2.5 Kg |
| Haifa Chemicals Ltd.之無水磷酸二鈉 | Na_2HPO_4 (無水磷酸二鈉) CAS號7558-79-4 | 11.25 Kg |
| Ametech之AgRH 23 | 三仙膠 CAS號11138-66-2 | 0.25 Kg |
| 軟水 | | 補足至1000 L(約423 kg) |

外觀：灰白色均勻懸浮液

密度，g/ml：1.15-1.35

穩定性結果：

【0571】 表5之組合物之穩定性結果概述於下表6中。

表6：穩定性結果

| | 開始 | 2週後 室內 | 2週後烘 箱54°C | 2週後 冷4°C | 2週後冷 10°C | 8週後烘 箱40°C |
|------------------|------------|------------|---------------|-------------|--------------|---------------|
| 外觀 | 灰白色 懸浮液 | 灰白色 懸浮液 | 輕相分離 | 灰白色 懸浮液 | 灰白色 懸浮液 | 相分離 |
| 式I化合物之 濃度 | 57.10% | 56.5% | 55.2% | 56.3% | 56.3% | -- |
| 密度，g/ml | 1.314 | 1.275 | 1.215 | 1.27 | 1.252 | 1.279 |
| pH | 6.6 | 6.6 | 6.5 | 6.5 | 6.6 | 6.36 |
| 黏度， sp.62(cP) | 1400 | 1800 | 1040 | 690 | 1460 | 1410 |
| D ₉₀ | 4.7 | 4.95 | 5.76 | 4.8 | 4.84 | 5.43 |

實例4：具有兩種內置式佐劑之450 SC組合物

【0572】 如下製備含有450 g/L式I化合物及兩種內置式佐劑(PVP及Silwet® L-077)之懸浮液濃縮物(SC)調配物：

步驟I：農業上可接受之惰性添加劑預混合物之製備

【0573】 將軟水及Van Gel® B饋入容器中，且將溶液混合(高剪切)。將容器之內容物加熱至60°C。將SOPROPHOR® TS/54(TSP 54)加熱至50-60°C，且逐漸添加至容器中。隨後，添加Supragil® WP、Soprophor® 3D33、KH₂PO₄、Na₂HPO₄及SAG。

步驟II：式I化合物之製備

【0574】 向內部具有界面活性劑之預混合物中添加式I化合物(40%

W/W)，形成懸浮液。在珠磨機(0.8-1.2 mm珠粒)中研磨懸浮液，直至粒徑達到 $d_{90} < 5 \mu\text{m}$ 。將懸浮液自反應器排至新容器中。

步驟III：組合物之完結

【0575】將丙二醇及PVP添加至經研磨之懸浮液中，且混合，直至獲得均一懸浮液。在混合同時，添加軟水及Ag RH 23 2%溶液，直至黏度達到1600-2200 cP。繼續混合，直至溶液均勻。根據CIPAC方法MT 192，藉由黏度計來量測黏度。

【0576】組合物概述於下表7中。

表7：具有PVP及Silwet® L-077之450 SC組合物

| 化學名稱及CAS | CAS號 | 用於1000 L(kg)之量 |
|---|---|---------------------|
| 式I化合物 | | 450 kg(469 kg，佔96%) |
| 二異丙基萘磺酸鈉 | CAS號1322-93-6(Solvay之Supragil WP或OXITENO之SURFOM HRB | 5.9 Kg |
| Solvay之Soprophor® 3 D 33 聚芳基苯基醚磷酸酯 | CAS號90093-37-1， 99734-09-5，7664-38-2 | 47.0 kg |
| Clariant之Emulsogen® TS 540或 Solvay之SOPROPHOR® TS/54 三苯乙烯基苯酚-聚乙二醇醚 | CAS號70559-25-0(Clariant)， 104376-75-2(Solvay) | 17.5 Kg |
| Ashland之PVP K-30 乙烯吡咯啉酮聚合物 | CAS號9003-39-8 | 17.5 Kg |

| | | |
|---|--------------------|------------------------|
| Momentive Performance Materials GmbH之SAG™ 1572 聚二甲基矽氧烷乳液 | CAS號N/A，6-81-5(甘油) | 2.0 Kg |
| Momentive之Silwet® L-077 經聚氧化烯改質之七甲基三矽氧烷， | CAS號 27306-78-1 | 9.0 kg |
| INEOS OXIDE之MPG-MPG USP或 SHELL EASTERN CHEMICALS之 MPG工業TG或 DOW之工業級丙二醇 1,2-丙二醇 | CAS號57-55-6 | 23.5 Kg |
| Rotem Amfert Negev Ltd.之MKP(磷酸氫二鉀)， KH ₂ PO ₄ (正磷酸二氫鉀) | CAS號7778-77-0 | 1.7 Kg |
| Haifa Chemicals Ltd之無水磷酸二鈉 Na ₂ HPO ₄ (無水磷酸二鈉) | CAS號7558-79-4 | 6.9 Kg |
| Vanderbilt minerals,LLC.之Van Gel® B 矽酸鎂鋁，膨潤石黏土； | CAS號12199-37-0 | 5.9 kg |
| Ametech之AgRH 23 三仙膠 | CAS號11138-66-2 | 2.8 Kg |
| 軟水 | | 補足至1000 L(約 590 kg) |

外觀：灰白色均勻懸浮液

密度，g/ml：1.15-1.20

實例5：具有VP/VA、Agnique® BP 420及Agnique® ME 18 RD-F之300 SE組合物

【0577】 如下製備含有300 g/L式I化合物及三種內置式佐劑(VP/VA、Agnique® BP 420及Agnique® ME 18 RD-F)之懸乳劑(SE)組合物：

步驟I：農業上可接受之惰性添加劑預混合物之製備

【0578】 將軟水及Van Gel® B饋入容器中且混合(高剪切)。將容器之內容物加熱至60°C。將SOPROPHOR® TS/54(TSP 54)加熱至50-60°C，且逐漸添加至容器中。向溶液中添加Supragil® WP、Soprophor® 3D33、KH₂PO₄、Na₂HPO₄及SAG。

步驟II：式I化合物之製備

【0579】 向內部具有界面活性劑之預混合物中添加式I化合物(40% W/W)，形成懸浮液。在珠磨機(0.8-1.2 mm珠粒)中研磨懸浮液，直至粒徑達到d₉₀<5 μm。將經研磨之懸浮液自反應器排至新容器中。

步驟III：有機相之製備

【0580】 向容器中饋入Agnique® ME RDF、Atlox™ 4914、Atlas™ G5002L、Genapol® X80及Agnique® BP 420，且混合，直至獲得均勻溶液。在向懸浮液中添加SE之前，將容器之內容物混合(高剪切)至少10 min，直至液滴尺寸達到D₉₀=10 μm。

步驟IV：組合物之完結

【0581】 將丙二醇及VP/VA添加至經研磨之懸浮液中，且混合，直至獲得均一懸浮液。以三次劑量，將SE溶液逐漸添加至經研磨之懸浮液中。在各劑量之間，在混合同時，添加Atlox™ 4913、軟水及Ag RH 23

2%溶液，直至黏度達到1600-2200 cP。繼續混合，直至獲得均勻溶液。
根據CIPAC方法MT 192，藉由黏度計來量測黏度。

【0582】組合物概述於下表8中。

表8：具有VP/VA、Agnique® BP 420及Agnique® ME 18 RD-F之
300 SE組合物

| 成分商標名 | 化學名稱及CAS | 功能 | 用於1000 L(kg)之量 |
|--|---|----|-----------------------|
| 式I化合物 | 5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-[4-甲基苯基)磺醯基]-3,4-二氫嘧啶-2(1H)-酮 CAS號N/A | | 300 kg(312.5 kg，佔96%) |
| Solvay之Supragil® WP，或 OXITENO之 SURFOM® HRB | 二異丙基萘磺酸鈉 CAS號1322-93-6 () | | 4.0 Kg |
| Solvay之Soprophor® 3 D 33 | 聚芳基苯基醚磷酸酯 CAS號90093-37-1，99734-09-5，7664-38-2 | | 31.5 kg |
| Clariant之Emulsogen® TS 540或 Solvay之 SOPROPHOR® TS/54 | 三苯乙炔基苯酚-聚乙二醇醚 CAS號70559-25-0(Clariant)， 104376-75-2(Solvay) | | 12.0 Kg |
| Ashland之Agrimer™ VA 6或 BASF之Sokalan® VA 64 P | 乙烯吡咯啉酮與乙酸乙烯酯共聚物之混合物 CAS號25086-89-9 | | 17.5 Kg |
| Momentive Performance Materials GmbH之 SAG™ 1572 | 聚二甲基矽氧烷乳液 CAS號N/A，56-81-5(甘油) | | 2.0 Kg |

| | | | |
|--|---|--|----------------------|
| INEOS OXIDE之MPG-MPG USP或 SHELL EASTERN CHEMICALS之MPG工業TG或 DOW之工業級丙二醇 | 1,2-丙二醇 CAS號57-55-6 | | 23.5 Kg |
| Rotem Amfert Negev Ltd.之MKP(磷酸氫二鉀) | KH_2PO_4 (正磷酸二氫鉀) CAS號7778-77-0 | | 1.2 Kg |
| Haifa Chemicals Ltd.之無水磷酸二鈉 | Na_2HPO_4 (無水磷酸二鈉) CAS號7558-79-4 | | 4.6 Kg |
| Vanderbilt minerals,LLC.之Van Gel® B | 矽酸鎂鋁，膨潤石黏土； CAS號12199-37-0 | | 4.0 kg |
| Agnique® ME 18 RD-F | 菜籽油脂肪酸甲酯。 CAS號 67762-38-3 | | 64.5 kg |
| Croda之Atlox™ 4914 | 無規共聚物(醇酸樹脂-PEG樹脂)。 CAS號N/A | | 9.5 kg |
| Croda之Atlas™ G5002L | 聚氧化烯嵌段共聚物。 CAS號N/A | | 29.0 kg |
| Croda之Genapol® X80 | 脂肪醇聚乙二醇醚。 CAS號9043-30-5 | | 13.0 kg |
| BASF之Agnique® BP 420 | 醇，C16-18，經乙氧基化丙氧基化。 CAS號 68002-96-0 | | 97.0 kg |
| Croda之Atlox™ 4913 | 甲醚甲基丙烯酸酯共聚物。 CAS號N/A. 丙二醇。CAS號57-55-6 | | 35.0 kg |
| Ametech之AgRH 23 | 三仙膠 CAS號11138-66-2 | | 1.0 Kg |
| 軟水 | | | 補足至1000 L(約511.0 kg) |

外觀：灰白色均勻懸浮液

密度，g/ml：1.14-1.18

實例6：具有PVP、Agnique® BP 420及Agnique® ME 18 RD-F之300 SE組合物

【0583】 如下製備含有300 g/L式I化合物及三種內置式佐劑(PVP、Agnique® BP 420及Agnique®ME 18 RD-F)之SE組合物：

步驟I：農業上可接受之惰性添加劑預混合物之製備

【0584】 將軟水及Van Gel® B饋入容器中且混合(高剪切)。將容器之內容物加熱至60°C。將SOPROPHOR® TS/54(TSP 54)加熱至50-60°C，且逐漸添加至容器中。向溶液中添加Supragil® WP、Soprophor® 3D33、KH₂PO₄、Na₂HPO₄及SAG。

步驟II：式I化合物之製備

【0585】 向內部具有界面活性劑之預混合物中添加式I化合物(40% W/W)，形成懸浮液。在珠磨機(0.8-1.2 mm珠粒)中研磨懸浮液，直至粒徑達到d₉₀<5 μm。將經研磨之懸浮液自反應器排至新容器中。

步驟III：有機相之製備

【0586】 向容器中饋入Agnique® ME RDF、Atlox™ 4914、Atlas™ G5002L、Genapol® X80及Agnique® BP 420，且混合，直至獲得均勻溶液。在向懸浮液中添加SE之前，將容器之內容物混合(高剪切)至少10 min，直至液滴尺寸達到D₉₀=10 μm。

步驟IV：組合物之完結

【0587】 將丙二醇及PVP添加至經研磨之懸浮液中，且混合，直至獲得均一懸浮液。以三次劑量，將SE溶液逐漸添加至經研磨之懸浮液

中。在各劑量之間，在混合同時，添加Atlox™ 4913、軟水及Ag RH 23 2%溶液，直至黏度達到1600-2200 cP。繼續混合，直至獲得均勻溶液。根據CIPAC方法MT 192，藉由黏度計來量測黏度。

【0588】組合物概述於下表9中。

表9：具有PVP、Agnique® BP 420及Agnique® ME 18 RD-F之300 SE組合物

| 成分商標名 | 化學名稱及CAS | 用於1000 L(kg)之量 |
|--|---|-----------------------|
| 式I化合物。 | 5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-[4-甲基苯基]磺醯基]-3,4-二氫嘧啶-2(1H)-酮 CAS號N/A | 300 kg(312.5 kg，佔96%) |
| Solvay之Supragil® WP，或OXITENO之SURFOM® HRB | 二異丙基萘磺酸鈉 CAS號1322-93-6 | 4.0 Kg |
| Solvay之Soprophor® 3 D 33 | 聚芳基苯基醚磷酸酯 CAS號90093-37-1，99734-09-5，7664-38-2 | 31.5 kg |
| Clariant之Emulsogen® TS 540或Solvay之SOPROPHOR® TS/54 | 三苯乙炔基苯酚-聚乙二醇醚 CAS號70559-25-0(Clariant)，104376-75-2(Solvay) | 12.0 Kg |
| Ashland之PVP K-30或 | 乙炔吡咯啉酮聚合物 CAS號9003-39-8 | 17.5 Kg |
| Momentive Performance Materials GmbH之SAG™ 1572 | 聚二甲基矽氧烷乳液 CAS號N/A，56-81-5(甘油) | 2.0 Kg |

| | | |
|--|--|-------------------------|
| INEOS OXIDE之MPG-MPG USP或 SHELL EASTERN CHEMICALS之MPG工業TG 或 DOW之工業級丙二醇 | 1,2-丙二醇 CAS號57-55-6 | 23.5 Kg |
| Rotem Amfert Negev Ltd.之 MKP(磷酸氫二鉀) , | KH ₂ PO ₄ (正磷酸二氫鉀) CAS號7778-77-0 | 1.2 Kg |
| Haifa Chemicals Ltd.之無水 磷酸二鈉 | Na ₂ HPO ₄ (無水磷酸二鈉) CAS號7558-79-4 | 4.6 Kg |
| Vanderbilt minerals,LLC.之 Van Gel® B | 矽酸鎂鋁，膨潤石黏土； CAS號12199-37-0 | 4.0 kg |
| Agnique® ME 18 RD-F | 菜籽油脂肪酸甲酯。 CAS號 67762-38-3 | 64.5 kg |
| Croda之Atlox™ 4914 | 無規共聚物(醇酸樹脂-PEG樹 脂)。 CAS號N/A | 9.5 kg |
| Croda之Atlas™ G5002L | 聚氧化烯嵌段共聚物。 CAS號N/A | 29.0 kg |
| Croda之Genapol® X80 | 脂肪醇聚乙二醇醚。 CAS號9043-30-5 | 13.0 kg |
| BASF之Agnique® BP 420 | 醇，C16-18，經乙氧基化丙氧 基化。 CAS號 68002-96-0 | 97.0 kg |
| Croda之Atlox™ 4913 | 甲醚甲基丙烯酸酯共聚物。 CAS號N/A. 丙二醇。CAS號57-55-6 | 35.0 kg |
| Ametech之AgRH 23 | 三仙膠 CAS號11138-66-2 | 1.0 Kg |
| 軟水 | | 補足至1000 L(約511.0 kg) |

外觀：灰白色均勻懸浮液

密度，g/ml：1.14-1.18

實例7：在大致7之pH下不具有穩定化界面活性劑之懸浮液濃縮物(SC)組合物

【0589】 如下製備含有450 g/L式I化合物且不含穩定化界面活性劑之懸浮液濃縮物(SC)調配物：

【0590】 在水中，添加4% Atlox™ 4913、2% Ethylan™ NS 500 LQ/Antarox® B 848、0.5% Supragil® WP及0.1%消泡劑(SAG™ 1572)，且混合，直至獲得均勻溶液。

【0591】 在混合(高剪切)同時，添加式I化合物。進行混合5分鐘。將混合物與幾個珠粒一起置於Tinky中20分鐘。

【0592】 將其餘材料插入至懸浮液中且混合，分至小瓶中且置於室內及烘箱中。

【0593】 調配物概述於表10中。

表10：pH大致= 7之式I化合物之450 SC組合物

| 原料 | CAS號 | 1000公升(高達1180 kg，其中密度為1.18公克/毫升)之數量 |
|---|------------|-------------------------------------|
| 式I化合物技術含量，100% | | 450 kg(469 kg，佔96%) |
| 4% Atlox™ 4913 | 1322-93-6 | 47 |
| 2% Ethylan™ NS 500 LQ /Antarox® B 848 | 90093-37-1 | 24 |
| 0.5% Supragil® WP | 70559-25-0 | 59 |
| 丙二醇 | 57-55-6 | 24 |
| SAG™ 1572 (聚二甲基矽氧烷消泡乳液) | 商品秘密 | 30 |
| 三仙膠AG RH 2.0% | 11138-66-2 | 118 |
| KH ₂ PO ₄ (磷酸二氫鉀) | 7778-77-0 | 1.7 |
| Na ₂ HPO ₄ (磷酸二鈉) | 7558-79-4 | 6.9 |
| DI水 | | 補足至1000 L(約419.4 kg) |

穩定性結果

【0594】 將SC組合物置於室溫中及烘箱(54°C)中24小時，且檢查濃度。觀測結晶狀顆粒，且量測式I化合物之降解。結果顯示，式I化合物之濃度降低了10%。

實例8：在pH 3.5下具有穩定化界面活性劑之懸浮液濃縮物組合物

【0595】 如下製備含有450 g/L式I化合物及兩種穩定化界面活性劑(Soprophor® 3D33及Soprophor® TS/54)之懸浮液濃縮物(SC)調配物：

步驟I：農業上可接受之惰性添加劑預混合物之製備

【0596】 向含有預熱SOPROPHOR® TS/54(TSP 54)之容器中，逐漸添加軟水。將容器之內容物混合，且加熱至50-65°C，直至獲得均勻溶液。向溶液中添加Supragil® WP、Soprophor® 3D33、KH₂PO₄、Na₂HPO₄及SAG™ 1572。

步驟II：式I化合物之製備

【0597】 向內部具有界面活性劑之預混合物中添加式I化合物(40% W/W)，形成懸浮液。在珠磨機(0.8-1.2 mm珠粒)中研磨懸浮液，直至粒徑達到d₉₀<5 μm。將經研磨之懸浮液自反應器排至新容器中。

步驟III：組合物之完結

【0598】 將丙二醇添加至經研磨之懸浮液中，且混合，直至獲得均一懸浮液。在混合同時，向懸浮液中添加軟水及AgRH 23 2%溶液，直至黏度達到1600-2200 cP。繼續混合，直至獲得均勻溶液。根據CIPAC方法MT 192，藉由黏度計來量測黏度。

【0599】 組合物概述於表11中。

表11：pH = 3.5之式I化合物之450 SC組合物

| 成分商標名 | 化學名稱及CAS號 | 用於1000 L(kg)之量 |
|--|---|------------------------|
| 式I化合物技術含量，100% 之ADAMA Makhteshim LTD. | 5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-[4-甲基 苯基)磺醯基]-3,4-二氫嘧啶- 2(1H)-酮 CAS號N/A | 450 kg(469 kg，佔96%) |
| Solvay之Supragil® WP，或 OXITENO之SURFOM® HRB | 二異丙基萘磺酸鈉 CAS號1322-93-6 | 5.9 Kg |
| Solvay之Soprophor® 3 D 33 | 聚芳基苯基醚磷酸酯 CAS號90093-37-1，99734-09- 5，7664-38-2 | 47.0 kg |
| Clariant之Emulsogen™ TS 540或Solvay之 SOPROPHOR® TS/54 | 三苯乙炔基苯酚-聚乙二醇醚 CAS號70559-25-0(Clariant)， 104376-75-2(Solvay) | 17.5 Kg |
| Momentive Performance Materials GmbH之SAG™ 1572 | 聚二甲基矽氧烷乳液 CAS號N/A，56-81-5(甘油) | 2.0 Kg |
| INEOS OXIDE之MPG-MPG USP或 SHELL EASTERN CHEMICALS之MPG工業TG 或 DOW之工業級丙二醇 | 1,2-丙二醇 CAS號57-55-6 | 23.5 Kg |
| Ametech之AgRH 23 | 三仙膠 CAS號11138-66-2 | 2.8 Kg |
| 軟水 | | 補足至1000 L(約621 kg) |

穩定性結果：

【0600】 在54°C下烘箱中加速儲存2週之後，濃度降低6%。觀測到少量結晶狀顆粒。然而，式I化合物之濃度降低。

【0601】 因此，必須將組合物之pH維持在5.0-7.5範圍內，以便得到穩定的SC調配物。

實例9：在pH 4及8下之具有穩定化界面活性劑之懸浮液濃縮物組合物

【0602】 表12顯示兩種SC組合物(BN 161213-5-Sop3d_TSP54_PG及BN 161213-6-Sop3d_TSP54_PG)，其各自含有兩種穩定化界面活性劑(Soprophor® 3D33及Soprophor® TS/54)。BN 161213-5-Sop3d_TSP54_PG具有4 之低pH，且BN 161213-6-Sop3d_TSP54_PG具有8 之高pH。

【0603】 兩種組合物均不穩定。在第一組合物中烘箱中之濃度降低，且對於第二組合物觀測到主要黏度提高。根據CIPAC方法MT 192，藉由黏度計來量測黏度。

表12：在pH 4及8下之SC組合物之比較

| 組成： | BN 161213-5-Sop3d_TSP54_PG PH4 | | | BN 161213-6-Sop3d_TSP54_PG PH8 | | |
|----------------------------|-----------------------------------|--------|---------|-----------------------------------|--------|---------|
| | W/W% | g/1L | g/2.5 | W/W% | g/1L | g/2.5 |
| 式I化合物 | 44.51 | 489.58 | 1223.96 | 44.51 | 489.58 | 1223.96 |
| Supragil® WP | 0.50 | 5.50 | 13.75 | 0.50 | 5.50 | 13.75 |
| Soprophor® 3d33 | 4.00 | 44.00 | 110.00 | 4.00 | 44.00 | 110.00 |
| TSP54 | 1.50 | 16.50 | 41.25 | 1.50 | 16.50 | 41.25 |
| SAG™1572 | 0.15 | 1.65 | 4.13 | 0.15 | 1.65 | 4.13 |
| 水 | 32.24 | 354.67 | 886.67 | 31.84 | 350.27 | 875.67 |

| | | | | | | |
|--|--|---------|---------|--|---------|---------|
| 小計 | 82.90 | 911.90 | 2279.75 | 82.50 | 907.50 | 2268.75 |
| 研磨參數：5個循環，前兩個在2500-3000 rpm下，第三個在3100 rpm下，且最後兩個在3500-3600 rpm下(溫度24-28°C) | | | | | | |
| 在研磨之後，將經研磨之溶液分成幾批 | | | | | | |
| 經研磨之調配物 總計：2000公克 | | | | | | |
| | | | 200.00 | | | 200.00 |
| 因子 | | | 0.09 | | | 0.09 |
| 三仙膠Ag/RH 2% | 12.00 | 132.00 | 28.95 | 12.00 | 132.00 | 28.95 |
| 丙二醇 | 5.00 | 55.00 | 12.06 | 5.00 | 55.00 | 12.06 |
| 檸檬酸 | 0.10 | 1.10 | 0.24 | 0.00 | 0.00 | 0.00 |
| 檸檬酸三鈉 | | | | 0.50 | 5.50 | 1.21 |
| 脲 | 0.00 | 0.00 | 0.00 | 0.00 | 0.00 | 0.00 |
| 總計 | 100.0 | 1100.00 | 241.25 | 100.0 | 1100.00 | 242.22 |
| | BN 161213-5- Sop3d_TSP54_PG PH4 | | | BN 161213-6- Sop3d_TSP54_PG PH8 | | |
| PH | 4 | | | 8 | | |
| 黏度(cP)12 rpm S62 | 1440 | | | 1610 | | |
| 式I化合物之濃度(%) | 44.4 | | | 37.7 | | |
| 烘箱2W 54°C之 式I化合物之濃度(%) | 36.4 | | | 38 | | |
| 註釋 | 出現黏度提高且結晶 | | | 出現黏度提高，聚集及結晶。 | | |

【0604】當pH較低，亦即pH 4時，式I化合物降解。在實例12中，組合物中之式I化合物之量自按組合物之總重量計之44.4重量%降低至按組合物之總重量計之31.1重量%。當pH較高時，組合物之物理穩定性降低。在實例12中，組合物變得不均勻，且黏度升高。

【0605】 結論為，需要將組合物之pH維持在5.0-7.5之範圍內，以便得到穩定的SC調配物。

實例10：具有Agnique ME 18 RD-F之250 OD組合物(OD 組合物A)

【0606】 如下製備含有250 g/L式I化合物之油分散液(OD)組合物：

步驟I：於非水性載體(脂肪酸酯)中之農業上可接受之惰性添加劑預混合物之製備

【0607】 使用大圓孔Silverson混合器，在高剪切(3000 rpm)下，向Agnique® ME 18 RD-F中添加Bentone SD®-1，且混合5分鐘。

【0608】 在膠磨機(IKA MagicLab)中研磨混合物，直至在10 s⁻¹下之黏度不再顯著地增加(50次)。根據CIPAC方法MT 192，藉由黏度計來量測黏度。

【0609】 向適合的容器中添加Agnique® ME 18 RD-F，且添加預凝膠且混合5分鐘。

【0610】 添加乳化劑及分散劑，且混合15分鐘直至均勻。

步驟II：式I化合物之製備

【0611】 在攪動下添加式I化合物且混合，直至均勻。在添加所有活性成分後，混合15分鐘。

步驟III：組合物之完結

【0612】 在Eiger mini motor磨機(80% 0.75 mm-1.0 mm珠粒，以4000 rpm饋入)中研磨樣本15分鐘。

【0613】 調配物概述於表13中。

表13：式I化合物之250 OD組合物(A)

| 成分 | w/w% |
|---------------------|---------------|
| 式I化合物 | 25 |
| Atlox™ 4912 | 5 |
| Atlox™ 4915 | 2 |
| Rhodocal® 70/B | 5 |
| Genapol® X 080 | 4 |
| Genapol® X 050 | 8 |
| Bentone SD®-1 | 1.5 |
| Agnique® ME 18 RD-F | 補足至100%(49.5) |

密度1公克/毫升

實例11：具有Agnique® ME 18 RD-F之250 OD組合物(OD組合物

B)：

【0614】 如下製備含有250 g/L式I化合物之油分散液(OD)組合物：

步驟I：於非水性載體(脂肪酸酯)中之農業上可接受之惰性添加劑預混合物之製備

【0615】 使用大圓孔Silverson混合器，在高剪切(3000 rpm)下，向Agnique® ME 18 RD-F中添加Bentone SD®-1，且混合5分鐘。

【0616】 在膠磨機(IKA MagicLab)中研磨混合物，直至在 10 s^{-1} 下之黏度不再顯著地增加(50次)。根據CIPAC方法MT 192，藉由黏度計來量測黏度。

【0617】 向適合的容器中添加Agnique® ME 18 RD-F，且添加預凝膠且混合5分鐘。

【0618】 添加乳化劑及分散劑，且混合15分鐘直至均勻。

步驟II：式I化合物之製備

【0619】 在攪動下添加式I化合物且混合，直至均勻。在添加所有活性成分後，混合15分鐘。

步驟III：組合物之完結

【0620】 在Eiger mini motor磨機(80% 0.75 mm-1.0 mm珠粒，以4000 rpm饋入)中研磨樣本15分鐘。

【0621】 調配物概述於表14中。

表14：式I化合物之250 OD組合物(B)

| 成分 | w/w% |
|----------------------------|------|
| 式I化合物 | 25 |
| Atlox™ 4912 | 2 |
| Atlox™ 4915 | 1.25 |
| Aerosol® OT-SE | 5 |
| Genapol® x80 | 5 |
| Rhodasurf® LA30 | 5 |
| Bentone SD®-1 | 1.25 |
| Agnique® ME 18-RD-F(溶劑/佐劑) | 55.5 |

【0622】 實例11之組合物物理上穩定，但在54°C下儲存2週之後觀測到化學降解(<10%之式I化合物降解)。

實例12：具有Agnique® ME 18 RD-F之250 OD組合物(OD組合物C)：

【0623】 使用類似於實例10及11之方法，來製備含有250 g/L式I化合物之油分散液(OD)組合物。

【0624】 調配物概述於表10中。

表15：式I化合物之250 OD組合物(C)

| 組分 | 重量 |
|---------------------|--------|
| 式I化合物 | 250 |
| Atlox™ 4912 | 30 |
| Atlox™ 4915 | 20 |
| Genapol® X080 | 37.5 |
| Genapol® X050 | 75 |
| Bentone SD®-1 | 5 |
| Attagel® 50 | 5 |
| Rhodacal® 70/B | 50 |
| Agnique® ME 18 RD-F | 補足至1公升 |

【0625】 將實例12之組合物儲存在54°C下2週，且未觀測到式I化合物之顯著降解。

實例13：具有Agnique® ME 18 RD-F之250 OD組合物

步驟I：於非水性載體(脂肪酸酯)中之農業上可接受之惰性添加劑預混合物之製備

【0626】 向適合的容器中添加Agnique® ME 18 RD-F，且添加預凝膠且混合5分鐘。

【0627】 添加乳化劑及分散劑，且混合15分鐘直至均勻。

步驟II：式I化合物之製備

【0628】 在攪動下添加式I化合物且混合，直至均勻。在添加所有活性成分後，混合15分鐘。

【0629】 在膠磨機(IKA MagicLab)中研磨混合物，直至在10 s⁻¹下之黏度不再顯著地增加(50次)。根據CIPAC方法MT 192，藉由黏度計來量測黏度。

步驟III：組合物之完結

【0630】在Eiger mini motor磨機(80% 0.75 mm-1.0 mm珠粒，以4000 rpm饋入)中研磨樣本15分鐘。

表16：式I化合物之250 OD組合物(A)

| 成分 | w/w% |
|-------------------------------|---------------|
| 式I化合物 | 25 |
| Atlox™ 4912 | 3 |
| Atlox™ 4915 | 2 |
| Rhodocal® 70/B或Aerosol® OT-SE | 6 |
| Alkamuls® BR或Atlas™ G5002L | 4 |
| Genapol® X 050 | 3 |
| Agnique® ME 18 RD-F | 補足至100%(49.5) |

表17.式I化合物-250 g/L OD調配物規格

| 特徵 | 規格 |
|--------------------------|------------------------|
| 外觀 | 棕色至白色，均勻液體 |
| 持久泡沫(CIPAC MT 47.3) | 在1分鐘之後，<60 mL |
| pH(1%去離子水，CIPAC MT 75.3) | 4 - 9 |
| 在10 s ⁻¹ 下之黏度 | >500 mPa.s |
| 屈服應力 | >1 Pa |
| 分散穩定性(CIPAC MT 180) | 在30分鐘之後，<2 mL分離 |
| 濕篩(CIPAC MT 185) | <2%滯留在75 μm篩上 |
| 粒徑(CIPAC MT 187) | D(50)μm：<4，D(90)μm：<20 |

實例14：包括式I化合物之EC組合物

【0631】製備三種可乳化濃縮物(EC)組合物(A、B及C)，其各自含有50 g/L式I化合物。

【0632】製備組合物C之方法在下文概述。(可使用類似方法來製備組合物A及B。)

1. 將Alkamuls® 14/R(CO60)熔融在50°C下之熱浴/烘箱中；
2. 向容器中饋入乙酸苯甲酯及碳酸仲丙酯，且加熱至50°C；
3. 在混合同時，向反應器中添加式I化合物，直至獲得澄清溶液；
4. 在混合同時，向反應器中逐漸添加Ninate® 60、TSP16及熔融Alkamuls® 14/R(4)，直至獲得澄清溶液；
5. 繼續混合1小時，同時將反應器冷卻至室溫；及
6. 經由過濾器(5 µm)，自反應器排出溶液。

【0633】組合物A、B及C分別概述於表18、19及20中。組合物B及C之穩定性結果概述於表21及22中。

表18：EC調配物A

| 原料 | 製造 | CAS號 | 功能 | 1000公升之數量 |
|-------------------------------|----------|------------|-------|--------------------|
| 式I化合物 | | | A.I. | 50 kg(52 kg, 佔96%) |
| JEFFSOL® AG 1705 乙酸苯甲酯 | Hunstman | 140-11-4 | 溶劑 | 730 kg |
| Nansa® EVM 70/2E 十二烷基苯磺酸鈣 | Hunstman | 90194-25-6 | 界面活性劑 | 78 kg |
| Toximul® 8320 eo/po 嵌段共聚物 | Stepan | 9038-95-5 | 界面活性劑 | 46.8 kg |
| Synperonic® 13/10乙 氧化十三烷醇 | Croda | 24938-91-8 | 界面活性劑 | 31.2 |
| Hallcomid® M-8-10 二甲基脂肪酸醯胺 | Stepan | 45280-17 | 溶劑 | 104 |

密度，g/ml：1.04

表19：EC調配物B

| 原料 | 製造商 | CAS號 | 功能 | 1000公升之數量 |
|---------------------------|------------|------------|-------|--------------------|
| 式I化合物 | | | A.I. | 50 kg(52 kg, 佔96%) |
| JEFFSOL® AG 1705 乙酸苯甲酯 | Hunstman | 140-11-4 | 溶劑 | 834.0 kg |
| Genagen® NBP N丁 基吡咯啉酮 | Clariant | 3470-98-2 | 共溶劑 | 104 kg |
| 蓖麻油氧化乙烯(20) | Akzo Nobel | 61791-12-6 | 界面活性劑 | 26 kg |
| 蓖麻油氧化乙烯(60) | Akzo Nobel | 61791-12-6 | 界面活性劑 | 26 kg |

表20：調配物B之穩定性結果

| | |
|-----------------|---------------------|
| 外觀 | 淡黃色溶液 |
| 密度, g/ml | 1.04 |
| pH | 5.2 |
| 乳液穩定性(0.2%, 1%) | 在2小時之後, 最大0.2 ml分離。 |
| 冷測試 | 無晶體生長 |

表21：EC調配物C

| 成分商標名 | 化學名稱及CAS號 | 用於1000 L(kg)之量 |
|---|--|-----------------------------|
| 式I化合物技術含量, 100%之 ADAMA Makhteshim LTD. | 5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-[4-甲基 苯基)磺醯基]-3,4-二氫嘧啶- 2(1H)-酮 CAS號N/A | 50 kg(52.1 kg, 佔 96%) |
| Solvay之ALKAMULS® 14/R | 乙氧基化蓖麻油 CAS號61791-12-6 | 10.4 Kg |
| Solvay之RHODACAL® 60/BE或 Cognis之AGNIQUE® ABS 60 C-EH或 Innospec之NANSA® EVN 70/2E | 苯磺酸, C10-13-(直鏈)烷基衍 生物, 鈣鹽 CAS號104-76-7(2-乙基己-1- 醇), 57-55-6(丙二醇, 僅針對 NANSA) | 34.6 Kg |

| | | |
|---|--|----------------------------|
| Solvay之SUPROPHOR® TS/16或 Clariant之EMULSOGEN® TS 160或 BASF之Agnique® TSP 16 | 三苯乙烯基苯酚-聚乙二醇醚 CAS號104376-75-2(僅針對 Solvay)，99734-09-5(僅針對 Solvay及BASF)，70559-25-0(僅 針對Clariant) | 69.2 Kg |
| BASF之碳酸伸丙酯 | 碳酸伸丙酯 CAS號108-32-7 | 87.3 Kg |
| Hunstman之乙酸苯甲酯或 Tennants fine chemicals LTD 之乙酸苯甲酯 | 乙酸苯基甲酯 CAS號140-11-4 | 補足至1000 L(約788.5 kg) |

密度，g/ml：1.04

表22：組合物C之穩定性結果

| | 開始 | 室內 | 烘箱54°C | 烘箱 40°C | 冷 10°C | 冷 4°C |
|------------------------|---------|-----------------|-----------------|------------|-----------|----------|
| 外觀 | 澄清淡黃色溶液 | 澄清淡黃色溶液 | 澄清淡黃色溶液，在底部極少混濁 | | 無晶體生長 | 無晶體生長 |
| 式I化合物之濃度 | 5.00% | 4.869%(降低2.62%) | 4.814%(降低3.72%) | | | |
| 乳液穩定性， 0.2%(水D，2小時) | | 好 | 好 | | | |
| 乳液穩定性 1.0%(水D，2小時) | | 好 | 好 | | | |
| 密度(公克/毫升) | | 1.0821 | 1.0823 | | | |
| ph(1%) | | 6.65 | 6.64 | | | |
| 起泡0.2% (水D，2小時) | | 60 ml | 60 ml | | | |
| 起泡1% (水D，2小時) | | 10 ml | 10 ml | | | |

實例15：包括式I化合物及佐劑之組合物之槽式混合物

實例15(a)：與佐劑槽式混合之SC組合物

【0634】小麥作物(冬小麥植物栽培種 Alixan(Limagrain)，在

BBCH 12生長階段)，用不同濃度之包括式I化合物及佐劑之組合物處理，所述組合物作為內置式組合物及/或作為槽式混合物施用。

【0635】在對應於200 L/ha體積之水中，製備所有所測試組合物及混合物，且在製備後3小時使用。

【0636】將實例1之SC組合物與Trycol®(0.2或0.4公升/公頃)或Silwet(0.01公升/公頃)混合，其作為槽式混合物添加在200 L體積之水中。

【0637】在2巴之操作壓力下，用手動噴霧器施用組合物及混合物。對於所測試之每一條件，使用各6株小麥植物之三個重複(盆)。

【0638】在處理之後，使小麥植物在室溫下乾燥1小時，且隨後在氣候室中培育：溫度為白天24°C/夜晚18°C，光週期為16 h光照/8 h黑暗，且相對濕度為65%。

【0639】切下第一葉片之片段，且轉移至含有適量水瓊脂之皮氏培養皿(Petri dish)中(6葉片片段/皮氏培養皿)。對片段接種小麥葉枯病菌菌株Mg Tri-R6之經校準孢子懸浮液。

【0640】在接種之後，在氣候室中培育培養皿：溫度為白天20°C/夜晚17°C，光週期為16 h光照/8 h黑暗，及受控相對濕度。

【0641】在培育21天時間之後，評定感染強度，其為由小麥葉枯病菌菌株定殖葉片之表面(定量標準)。隨後，以未處理對照之百分比為單位，測定各組合物之殺真菌功效。藉由統計軟體(XL STAT)來處理所有資料。此步驟之預期結果為在不同佐劑存在下式I化合物之生物學殺真菌效率排名。

【0642】在接種後21天(dpi)，藉由量測葉片片段之壞死長度，進行

疾病評定。隨後，以葉片片段之全長之百分比為單位，測定感染強度。

【0643】基於在疾病進展曲線(AUDPC)(其為疾病強度隨著時間推移之定量量測)下之面積，來計算功效。藉由將各對鄰近時間點之間的平均疾病強度乘以對應時間間隔(且對於此，各間隔時間)，來執行用於評估AUDPC之最常用方法(梯形方法)。

【0644】根據AUDPC值，判定殺真菌劑功效，且以未處理控制之百分比為單位來表述。

結果及論述

【0645】針對小麥葉枯病菌菌株MG Tri-R6，單獨測試所有佐劑。在受控條件下，單獨測試之佐劑中無一者對於小麥葉枯病菌菌株Mg Tri-R6具有任何顯著殺真菌活性。

【0646】結果概述於圖1至6中。

【0647】結果顯示，添加佐劑增加式I化合物針對小麥葉枯病菌菌株MG Tri-R6之功效。

【0648】如圖1及圖2中所示，相較於無佐劑之施用，添加一種佐劑Trycol®或Silwet®(甚至以很低的量)增加式I化合物之功效及有效殺真菌活性。

【0649】結果顯示，向槽式混合物中之式I化合物SC中添加Trycol®或Silwet®顯著地改良組合物之殺真菌功效。

【0650】不希望受到任何理論束縛之情況下，假設，Silwet® L-077及Trycol藉由降低葉片表面之表面張力而改良組合物之殺真菌功效(按組合物之總重量計，此佐劑之濃度為至多3重量%)。

【0651】如圖4、5及6中所示，相較於無佐劑之施用，與PVP或

VP/VA一起添加兩種佐劑Silwet®或Agnique® BP 420，增加式I化合物之功效及有效殺真菌活性。

【0652】相較於施用無佐劑之式I化合物，在PVP或VP/VA存在下，結合Agnique® BP 420(醇乙氧基化物丙氧基化物C16 C18)或Silwet®之式I化合物之功效增加。

【0653】不希望受任何理論束縛之情況下，假設，結合VP/VA之Silwet® L-077(矽氧烷聚氧化烯共聚物)(按組合物之總重量計，此佐劑之濃度為至多2重量%)藉由降低表面張力，因此將組合物擴散在葉片表面上，來增加式I化合物之功效及有效殺真菌活性。換言之，組合物在葉片表面上之沈積更分散，且在葉片上停留更長時間，因此具有耐雨特性。

實例15(b)：與佐劑槽式混合之EC組合物

【0654】恰好在實驗之前，將EC調配物與佐劑混合(例如呈槽式混合物形式)。

在對應於200 L/ha之體積之水或S-溶液(S-溶液係指組合物之稀釋溶液)中製備所有殺真菌劑，且在製備後3小時使用。

表23：

| 式I化合物50 EC調配物 | | | | | |
|---------------|------|----------------|------------|-----------|----------|
| A.I/ha (gr) | 處理數目 | 處理 | 調配物 (L/ha) | 佐劑 (L/ha) | 水 (L/ha) |
| 12.5 | 1 | 調配物A-無佐劑 | 0.25 | 0 | 200 |
| 6.25 | 2 | 調配物A-無佐劑 | 0.125 | 0 | 200 |
| 12.5 | 3 | 調配物A + Trycol® | 0.25 | 0.4 | 200 |
| 6.25 | 4 | 調配物A + Trycol® | 0.125 | 0.4 | 200 |
| 12.5 | 5 | 調配物B -無佐劑 | 0.25 | 0 | 200 |
| 6.25 | 6 | 調配物B -無佐劑 | 0.125 | 0 | 200 |
| 12.5 | 7 | 調配物B +低Trycol® | 0.25 | 0.2 | 200 |
| 6.25 | 8 | 調配物B +低Trycol® | 0.125 | 0.2 | 200 |

| | | | | | |
|------|----|----------------|-------|-----|-----|
| 12.5 | 9 | 調配物B + Trycol® | 0.25 | 0.4 | 200 |
| 6.25 | 10 | 調配物B + Trycol® | 0.125 | 0.4 | 200 |
| 12.5 | 11 | 調配物B + SOC | 0.25 | 1 | 200 |
| 6.25 | 12 | 調配物B +SOC | 0.125 | 1 | 200 |

【0655】 結果概述於圖7及8中。

實例16：OD組合物

【0656】 為了評定含有式I化合物之OD組合物之殺真菌活性，在對應於200 L/ha之體積之水或S-溶液(S-溶液係指組合物之稀釋溶液)中製備OD組合物(來自實例10，表13)，且在製備後3小時使用。

【0657】 小麥小植株栽培種 Alixan之第一葉片未經處理，或在接種小麥葉枯病菌菌株Mg Tri-R6(其在受控條件下對DMI具有中等抗性及對QoI殺真菌劑具有高度抗性)之孢子21天後，以10 g a.i./ha及20 g a.i./ha用式I化合物原型A之OD調配物(來自實例10，表13)處理。使用感染強度，來評定疾病。

【0658】 結果顯示於圖9中。

實例17：具有佐劑之OD組合物及EC組合物

【0659】 為了評定含有式I化合物之具有佐劑之OD組合物及EC組合物對於馬鈴薯晚疫病(致病疫黴)之殺真菌活性，在對應於300 L/ha之體積之水或S-溶液中製備OD組合物(來自實例10，表13)，且藉由背負式噴霧器：具有水平吊桿平坦扇形噴嘴施用(每週六次施用)。所使用之EC組合物為EC組合物C(實例14，表21)。

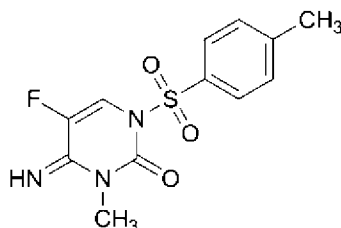
【0660】 使用感染百分比，來評定疾病。結果顯示於圖10中。

【發明申請專利範圍】

【請求項1】

一種穩定的液體組合物，其包括：

(a) 式I化合物：



式I

，及

(b) 液體載體，

其中：

- (i) 當該液體載體係水性液體載體時，該組合物之pH在5至7.5之間，且該組合物包括穩定化界面活性劑，該穩定的液體組合物中之該式I化合物之濃度為150 g/L至750 g/L；且
- (ii) 當該液體載體係非水性液體載體時，按該組合物之總重量計，該組合物具有小於0.5重量%之水含量，且該穩定的液體組合物中之該式I化合物之濃度為大於5重量%，按該組合物之總重量計。

【請求項2】

如請求項1之穩定的液體組合物，其中該液體載體係水性液體載體。

【請求項3】

如請求項2之穩定的液體組合物，其中該組合物之pH在6至7.5之範圍內。

【請求項4】

如請求項2之穩定的液體組合物，其中該組合物之pH在6至7之範圍

內。

【請求項5】

如請求項2之穩定的液體組合物，其中：

- a) 該組合物包含pH調節劑，
- b) 按該組合物之總重量計，該組合物包含30重量%至70重量%之該水性液體載體，及/或
- c) 該穩定的液體組合物中之該式I化合物之濃度為150 g/L至750 g/L。

【請求項6】

如請求項2之穩定的液體組合物，其中該組合物為懸浮液濃縮物 (suspension concentrate, SC)組合物，其中該式I化合物係懸浮於該水性液體載體中。

【請求項7】

如請求項2之穩定的液體組合物，其中該組合物為懸乳劑 (suspoemulsion, SE)組合物，其中該式I化合物係懸浮於該水性液體載體中且該組合物包含在該水性液體載體中之非水性液體組份。

【請求項8】

如請求項2之穩定的液體組合物，其中該組合物包括非離子性穩定化界面活性劑及陰離子性穩定化界面活性劑。

【請求項9】

如請求項2之穩定的液體組合物，其中該穩定化界面活性劑對於控制式I化合物之溶解度及/或降解係有效的。

【請求項10】

如請求項2或8之穩定的液體組合物，其中該穩定化界面活性劑具有聚氧化烯聚芳基醚之結構。

【請求項11】

如請求項2之穩定的液體組合物，其中該穩定化界面活性劑為三苯乙炔基苯酚乙氧基化物磷酸酯、具有54個EO之2,4,6-三-(1-苯乙基)-苯酚聚乙二醇醚、乙氧基化三苯乙炔基苯酚或其任何組合。

【請求項12】

如請求項2之穩定的液體組合物，其中該組合物包括兩種穩定化界面活性劑，且該等穩定化界面活性劑為三苯乙炔基苯酚乙氧基化物磷酸酯及乙氧基化三苯乙炔基苯酚。

【請求項13】

如請求項1之穩定的液體組合物，其中該液體載體係非水性液體載體。

【請求項14】

如請求項13之穩定的液體組合物，其中：

- a) 該非水性液體載體係選自由以下組成之群組：芳香烴、石蠟、石油、柴油、礦物油、脂肪酸酯及/或脂肪酸之醯胺、松油脂肪酸及其任何組合；
- b) 按該組合物之總重量計，該組合物包含30重量%至80重量%之該非水性液體載體，
- c) 按該組合物之總重量計，該組合物具有小於0.2重量%之含水量，
- d) 該組合物包括穩定化界面活性劑，及/或

- e) 該組合物不含磷酸、脲、沒食子酸丙酯、二甲亞砜(DMSO)、嗎啉及/或N-甲基吡咯啉酮。

【請求項15】

如請求項13之穩定的液體組合物，其中該組合物為油分散液(oil dispersion, OD)組合物，其中該式I化合物之固體顆粒係懸浮於該非水性液體載體中。

【請求項16】

如請求項13之穩定的液體組合物，其中該組合物為可乳化濃縮物(emusifiable concentrate, EC)組合物，其中該式I化合物係溶解於該非水性液體載體中。

【請求項17】

如請求項1之穩定的液體組合物，其中：

- a) 該式I化合物在該液體載體中之溶解度小於5000 ppm，
- b) 該組合物具有500 cP - 3000 cP之黏度，
- c) 該組合物包含農業上可接受之惰性添加劑，其中該農業上可接受之惰性添加劑係選自由以下組成之群：界面活性劑、分散劑、乳化劑、潤濕劑、消泡劑、溶劑、共溶劑、光穩定劑、UV吸收劑、自由基清除劑及抗氧化劑、黏著劑、中和劑、增稠劑、黏合劑、鉗合劑(sequestrates)、殺生物劑、緩衝劑、防腐劑及抗冷凍劑，
- d) 該組合物進一步包含固體稀釋劑、液體稀釋劑、濕潤劑、黏著劑、增稠劑、消泡劑、防腐劑、抗氧化劑、黏合劑、肥料、抗冷凍劑、額外農藥、安全劑或其任何組合，及/或

- e) 該組合物不含磷酸、脲、沒食子酸丙酯、二甲亞砜(DMSO)、嗎啉及/或N-甲基吡咯啉酮。

【請求項18】

如請求項1之穩定的液體組合物，其中該組合物進一步包括佐劑，其中所述佐劑係選自由以下組成之群組：

- (i) 聚氧化烯烷基醚；
- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；
- (iv) 乙烯吡咯啉酮及其衍生物；及
- (v) 糖基界面活性劑。

【請求項19】

如請求項18之穩定的液體組合物，其中：

- a) 按該組合物之總重量計，該組合物中之該佐劑之量係在0.1重量%與99重量%之間，及/或
- b) 該式I化合物與該佐劑之重量比為50:1至1:50。

【請求項20】

如請求項18之穩定的液體組合物，其中：

- a) 該佐劑為乙烯吡咯啉酮衍生物，
- b) 該佐劑為矽氧烷聚氧化烯共聚物，
- c) 該佐劑為聚乙炔吡咯啉酮，
- d) 該佐劑為C16-C18醇乙氧基化丙氧基醚，
- e) 該佐劑為乙氧基化十三烷醇或聚氧化乙烯(9)異十三醇，
- f) 該佐劑為脂肪酸酯與脂肪醇烷氧基化物之摻合物，及/或

g) 該佐劑為甲基化籽油與聚甘油酯之混合物。

【請求項21】

如請求項18之穩定的液體組合物，其中該佐劑為異十三烷醇聚乙二醇醚、乙氧基化物丙氧基化物醇、或C16-C18醇乙氧基化物丙氧基化物醚。

【請求項22】

如請求項18之穩定的液體組合物，其中該佐劑為C16-C18醇乙氧基化物丙氧基化物醚。

【請求項23】

如請求項18之穩定的液體組合物，其中該佐劑為矽氧烷聚氧化烯共聚物。

【請求項24】

如請求項18之穩定的液體組合物，其中該佐劑為菜籽油甲基化酯。

【請求項25】

如請求項18之穩定的液體組合物，其中該佐劑為乙烯吡咯啉酮與乙酸乙烯酯(vinylpyrrolidone and vinyl acetate, VP/VA)之嵌段共聚物。

【請求項26】

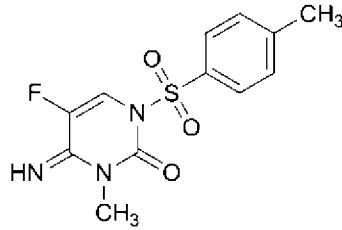
如請求項25之穩定的液體組合物，其中：

- a) 按該組合物之總重量計，該組合物中之VP/VA之量為0.5重量%-3重量%，或
- b) 該組合物為懸浮液濃縮物組合物，且按該組合物之總重量計，該懸浮液濃縮物組合物中之VP/VA之濃度為0.5重量%-2.5重量%。

【請求項27】

一種殺真菌混合物，其包括：

(a) 殺真菌有效量之式I化合物：



式I

；及

(b) 選自由以下組成之群組之佐劑：

- (i) 聚氧化烯烷基醚；
- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；
- (iv) 乙烯吡咯啉酮及其衍生物；及
- (v) 糖基界面活性劑，其中當該殺真菌混合物為組合物時，按該組合物之總重量計，該佐劑之量為至少3重量%，且當該殺真菌混合物為槽式混合物時，該糖基界面活性劑與該式I化合物之重量比為50:1至1:50之間。

【請求項28】

如請求項27之殺真菌混合物，其中：

- a) 殺真菌混合物為組合物或槽式混合物，
- b) 按該混合物之總重量計，該混合物中之該式I化合物之量係在1重量%與99重量%之間，
- c) 按該混合物之總重量計，該混合物中之該佐劑之量係在0.1重量%與99重量%之間，

- d) 按該混合物之總重量計，該殺真菌混合物中之該式I化合物及該佐劑之量為0.1重量%-99重量%，及/或
- e) 該式I化合物與該佐劑之重量比為50:1至1:50。

【請求項29】

如請求項27之殺真菌混合物，其中：

- a) 該佐劑為乙烯吡咯啉酮衍生物，
- b) 該佐劑為矽氧烷聚氧化烯共聚物，
- c) 該佐劑為聚乙烯吡咯啉酮，
- d) 該佐劑為C16-C18醇乙氧基化丙氧基醚，
- e) 該佐劑為乙氧基化十三烷醇或聚氧化乙烯(9)異十三醇，
- f) 該佐劑為脂肪酸酯與脂肪醇烷氧基化物之摻合物，及/或
- g) 該佐劑為甲基化籽油與聚甘油酯之混合物。

【請求項30】

如請求項29之殺真菌混合物，其中該乙烯吡咯啉酮衍生物為乙烯吡咯啉酮與乙酸乙烯酯(vinylpyrrolidone and vinyl acetate, VP/VA)之嵌段共聚物。

【請求項31】

如請求項27之殺真菌混合物，其中該混合物包含異十三烷醇聚乙二醇醚、乙氧基化物丙氧基化物醇、或C16-C18醇乙氧基化物丙氧基化物醚。

【請求項32】

如請求項27之殺真菌混合物，其中該混合物包含C16-C18醇乙氧基化物丙氧基化物醚。

【請求項33】

如請求項27之殺真菌混合物，其中該混合物包含矽氧烷聚氧化烯共聚物。

【請求項34】

如請求項27之殺真菌混合物，其中該混合物包含菜籽油甲基化酯。

【請求項35】

如請求項27之殺真菌混合物，其中該混合物包含乙烯吡咯啉酮與乙酸乙烯酯(vinylpyrrolidone and vinyl acetate, VP/VA)之嵌段共聚物。

【請求項36】

如請求項35之殺真菌混合物，其中：

- a) 按該混合物之總重量計，該混合物中之VP/VA之量為0.5重量%-3重量%，或
- b) 該混合物為懸浮液濃縮物組合物，且按該組合物之總重量計，該懸浮液濃縮物組合物中之VP/VA之濃度為0.5重量%-2.5重量%。

【請求項37】

如請求項27之殺真菌混合物，其中：

- a) 該殺真菌混合物包含聚乙炔吡咯啉酮及C16-C18醇乙氧基化物丙氧基化物醚，
- b) 該殺真菌混合物包含VP/VA及矽氧烷聚氧化烯共聚物，或
- c) 該殺真菌混合物包含VP/VA及C16-C18醇乙氧基化物丙氧基化物醚。

【請求項38】

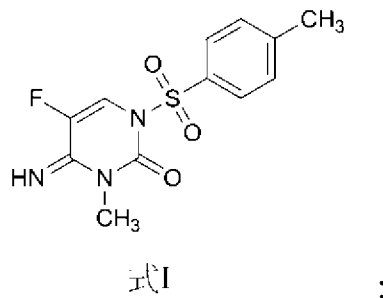
如請求項27之殺真菌混合物，其中該殺真菌混合物包含至少一種額外農藥。

【請求項39】

一種用於控制及/或預防(i)真菌病原體攻擊植物或(ii)植物及/或土壤真菌疾病之方法，其中所述方法包括向土壤、植物、根、葉、種子、所述真菌之部位及/或待預防所述感染之部位施用如請求項1至38中任一項之組合物或混合物，從而控制及/或預防真菌病原體攻擊一植物或植物及/或土壤真菌疾病。

【請求項40】

一種控制及/或預防(i)真菌病原體攻擊植物或(ii)植物及/或土壤真菌疾病之方法，其中所述方法包括向土壤、植物、根、葉、種子、所述真菌之部位及/或待預防所述感染之部位施用殺真菌有效量之具有以下式I之化合物：



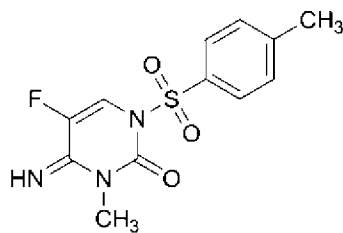
及至少一種佐劑，從而控制及/或預防真菌病原體攻擊所述植物或植物及/或土壤真菌疾病，其中所述佐劑係選自由以下組成之群組：

- (i) 聚氧化烯烷基醚；
- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；
- (iv) 乙烯吡咯啉酮及其衍生物；及

- (v) 糖基界面活性劑，其中當該殺真菌混合物為組合物時，按該組合物之總重量計，該佐劑之量為至少3重量%，且當該殺真菌混合物為槽式混合物時，該糖基界面活性劑與該式I化合物之重量比為50:1至1:50之間。

【請求項41】

一種用於改良式I化合物針對真菌病原體之生物活性之方法，所述方法包括在存在至少一種佐劑之情況下，施用式I化合物：



式I

其中所述佐劑係選自由以下組成之群組：

- (i) 聚氧化烯烷基醚；
- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；
- (iv) 乙烯吡咯啉酮及其衍生物；及
- (v) 糖基界面活性劑，

從而改良所述式I化合物之生物活性。

【請求項42】

如請求項40或41之方法，其中：

- a) 施用至少兩種佐劑，或在存在至少兩種佐劑之情況下施用所述式I化合物，
- b) 所述佐劑為乙烯吡咯啉酮與乙酸乙烯酯(vinylpyrrolidone and

vinyl acetate, VP/VA)之嵌段共聚物,

- c) 所述佐劑為矽氧烷聚氧化烯共聚物,
- d) 所述佐劑為聚乙烯吡咯啉酮,
- e) 所述佐劑為C16-C18醇乙氧基化丙氧基醚,
- f) 所述佐劑為乙氧基化十三烷醇或聚氧化乙烯(9)異十三醇,
- g) 所述佐劑為脂肪酸酯與脂肪醇烷氧基化物之摻合物, 及/或
- h) 所述佐劑為甲基化籽油與聚甘油酯之混合物。

【請求項43】

如請求項40或41之方法, 其中:

- a) 以在5 g/ha至150 g/ha範圍內之量施用所述式I化合物,
- b) 同時或依序施用所述式I化合物及所述佐劑,
- c) 將所述式I化合物及所述佐劑槽式混合,
- d) 所述式I化合物及所述佐劑經調配為單一組合物, 及/或
- e) 施用兩種或更多種佐劑, 且其中將所述佐劑中之至少一者與所述式I化合物槽式混合, 且將所述佐劑中之至少一者與所述式I化合物一起調配。

【請求項44】

如請求項40或41之方法, 其中:

- a) 所述真菌病原體為以下中之一者: 小麥葉斑病(禾生球腔菌(*Mycosphaerella graminicola*)); 無性型: 小麥葉枯病菌(*Zymoseptoria tritici*)、小麥褐銹病(小麥葉鏽菌(*Puccinia triticina*))、條銹病(小麥條形柄鏽菌屬(*Puccinia striiformis f. sp. tritici*))、蘋果瘡痂病(蘋果黑星病菌(*Venturia inaequalis*))、玉米黑粉病(玉米黑粉菌(*Ustilago maydis*))、葡

萄藤白粉病(葡萄白粉病菌(*Uncinula necator*))、大麥日燒病(大麥雲紋病菌(*Rhynchosporium secalis*))、稻瘟病(稻瘟菌(*Magnaporthe grisea*))、大豆銹病(大豆鏽菌(*Phakopsora pachyrhizi*))、小麥穎枯病(穎枯殼小球腔菌(*Leptosphaeria nodorum*))、小麥白粉病(小麥白粉病菌(*Blumeria graminis f. sp. tritici*))、大麥白粉病(大麥白粉病菌(*Blumeria graminis f. sp. hordei*))、葫蘆科白粉病(二孢白粉菌(*Erysiphe cichoracearum*))、葫蘆科炭疽病(瓜類小叢殼(*Glomerella lagenarium*))、甜菜葉斑病(甜菜尾孢菌(*Cercospora beticola*))、番茄早疫病(番茄早疫病菌(*Alternaria solani*))及大麥網斑病(大麥網斑病菌(*Pyrenophora teres*))，或

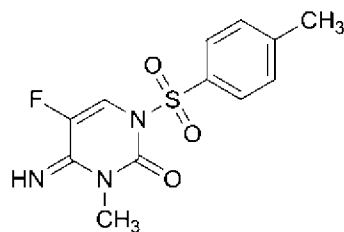
b) 所述植物或土壤真菌疾病為以下中之一者：葉斑病、褐銹病、黃銹病、白粉病、雲紋斑病、網斑病、微座孢斑病(*Microdochium majus*)、核盤菌病、霜黴病、疫黴病(*Phytophthora*)、甜菜葉斑病、柱隔孢病(*Ramularia*)、ASR.黑條葉斑病(*Sigatoka negra*)。

【請求項45】

如請求項40或41之方法，其中所述真菌病原體為小麥葉枯病菌菌株 Mg Tri-R6。

【請求項46】

一種用於增加液體組合物之穩定性之方法，該液體組合物包括式I化合物：



式I

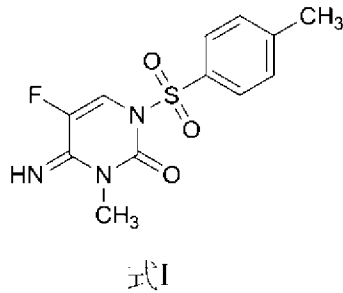
;

及液體載體，其中：

- (i) 當該液體載體係水性液體載體時，該方法包含將該組合物之pH值維持在5至7.5之範圍內，並添加至少一種穩定化界面活性劑至該組合物；及
- (ii) 當該液體載體係非水性液體載體時，該組合物中之該式I化合物之濃度為大於5重量%，按該組合物之總重量計，且該方法包含將組合物之水含量維持在小於0.5重量%，按該組合物之總重量計。

【請求項47】

一種具有聚氧化烯聚芳基醚之結構之至少一種穩定化界面活性劑之用途，其用於控制式I化合物之溶解度及/或降解：



【請求項48】

如請求項47之用途，其中該聚氧化烯聚芳基醚為具有經至少兩個芳族基取代之芳基之化合物。

【請求項49】

一種用於製備如請求項6之懸浮液濃縮物(SC)組合物之方法，其中該方法包括以下步驟：

- (1) 將農業上可接受之惰性添加劑與水性液體載體混合，得到預混合物；

(2) 向步驟(1)中獲得之所述預混合物中添加所述式I化合物，得到混合物；及

(3) 研磨步驟(2)所得混合物，得到所需組合物。

【請求項50】

一種用於製備如請求項7之懸乳劑(SE)組合物之方法，

其中該方法包括以下步驟：

(1) 將農業上可接受之惰性添加劑與水性液體載體混合，得到預混合物；

(2) 向步驟(1)中獲得之所述預混合物中添加所述式I化合物及至少一種佐劑，得到混合物；及

(3) 研磨步驟(2)所得混合物，得到所需組合物。

【請求項51】

一種用於製備如請求項15之油分散液(OD)組合物之方法，

其中該方法包括以下步驟：

(1) 將農業上可接受之惰性添加劑與非水性液體載體混合，得到預混合物；

(2) 向步驟(1)中獲得之所述預混合物中添加所述式I化合物，得到混合物；及

(3) 研磨步驟(2)所得混合物，得到所需組合物。

【請求項52】

一種用於製備如請求項16之可乳化濃縮物(emulsifiable concentrate, EC)組合物之方法，

其中該方法包括以下步驟：

(1) 將農業上可接受之惰性添加劑與非水性液體載體混合，得到預混合物；

(2) 向步驟(1)中獲得之所述預混合物中添加所述式I化合物，得到混合物；及

(3) 過濾步驟(2)之所述溶液，得到所需組合物。

【請求項53】

一種用於(i)控制或預防真菌攻擊植物或(ii)保護植物免於真菌攻擊之方法，其包括向將由其生長所述植物之種子施用如請求項1至38中任一項之組合物或混合物。

【請求項54】

一種處理植物種子或幼苗以產生對真菌攻擊具有抗性之植物之方法，其包括向所述植物種子或幼苗施用如請求項1至38中任一項之組合物或混合物。

【請求項55】

一種保護植物免於真菌攻擊之方法，其包括向所述幼苗環境施用如請求項1至38中任一項之組合物或混合物。

【請求項56】

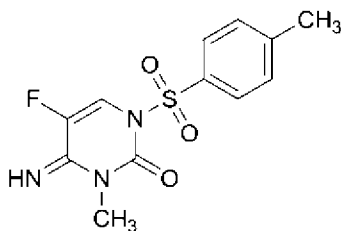
一種如請求項27至38中任一項之混合物之用途，其用於製造殺真菌組合物。

【請求項57】

一種如請求項1至38中任一項之組合物或混合物之用途，其用於(i)控制及/或預防真菌攻擊植物及/或(ii)控制及/或預防植物及/或土壤真菌疾病。

【請求項58】

一種具有式I之化合物及至少一種佐劑之用途，



式I

；

所述至少一種佐劑選自由以下組成之群組：

- (i) 聚氧化烯烷基醚；
- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；
- (iv) 乙烯吡咯啉酮及其衍生物；及

(v) 糖基界面活性劑，其中當該殺真菌混合物為組合物時，按該組合物之總重量計，該佐劑之量為至少3重量%，且當該殺真菌混合物為槽式混合物時，該糖基界面活性劑與該式I化合物之重量比為50:1至1:50之間，

其用於(a)控制及/或預防真菌病原體攻擊一植物及/或(b)控制及/或預防植物及/或土壤真菌疾病。

【請求項59】

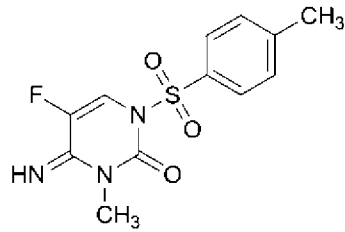
一種至少一種佐劑之用途，所述至少一種佐劑選自由以下組成之群組：

- (i) 聚氧化烯烷基醚；
- (ii) 矽氧烷聚氧化烯共聚物；
- (iii) 脂肪酸酯；

(iv) 乙烯吡咯啉酮及其衍生物；及

(v) 糖基界面活性劑，

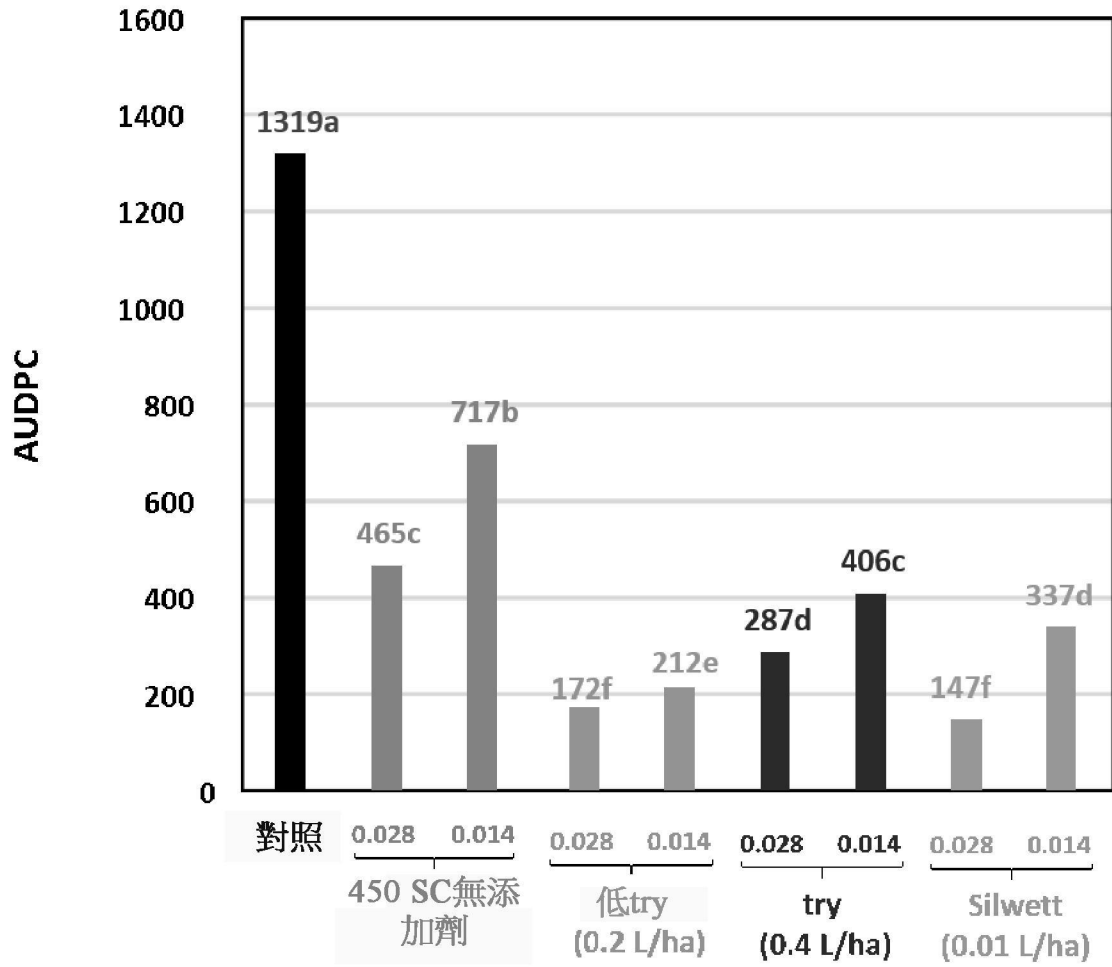
其用於改良所述式I化合物之生物活性：



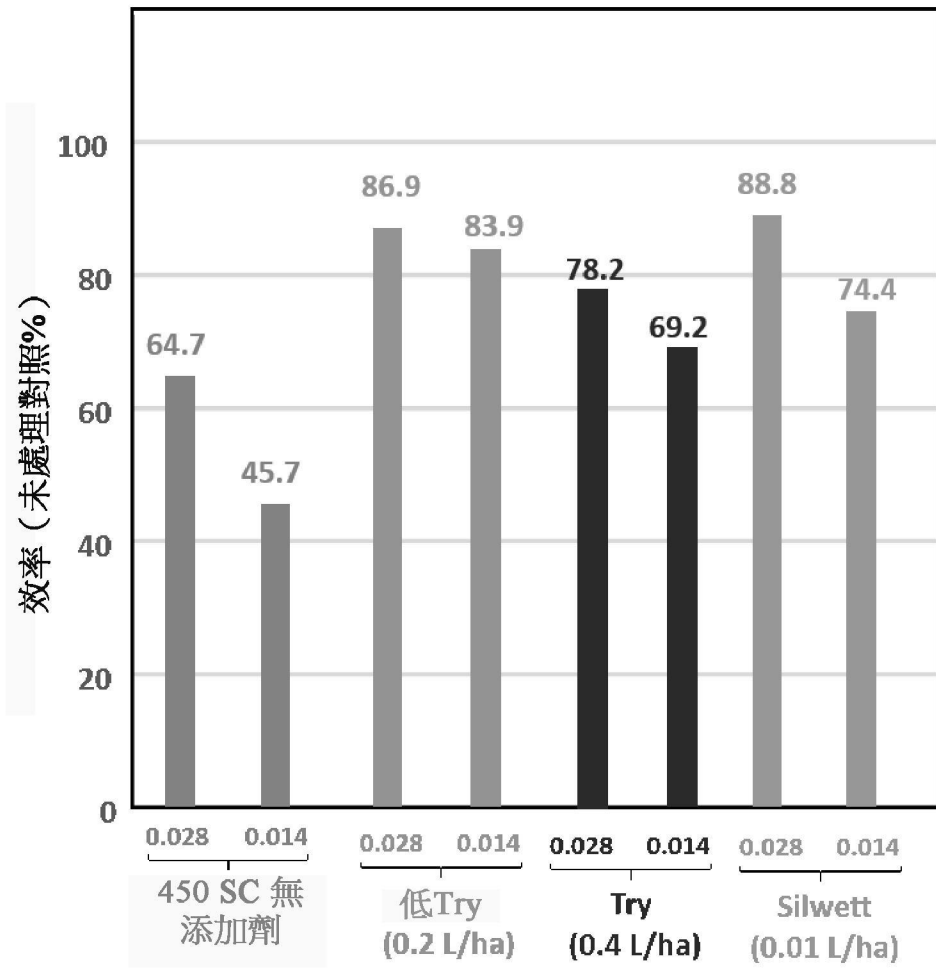
式I

。

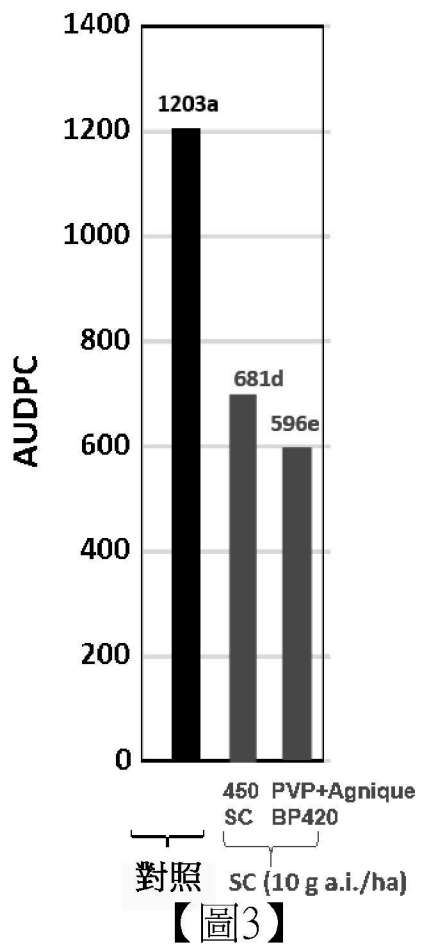
【發明圖式】



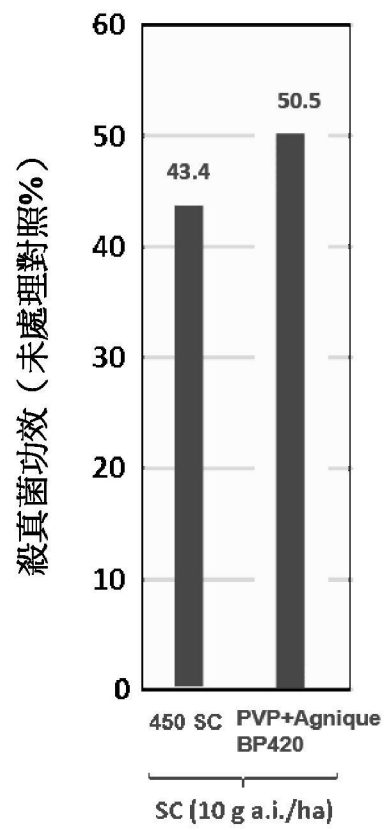
【圖1】



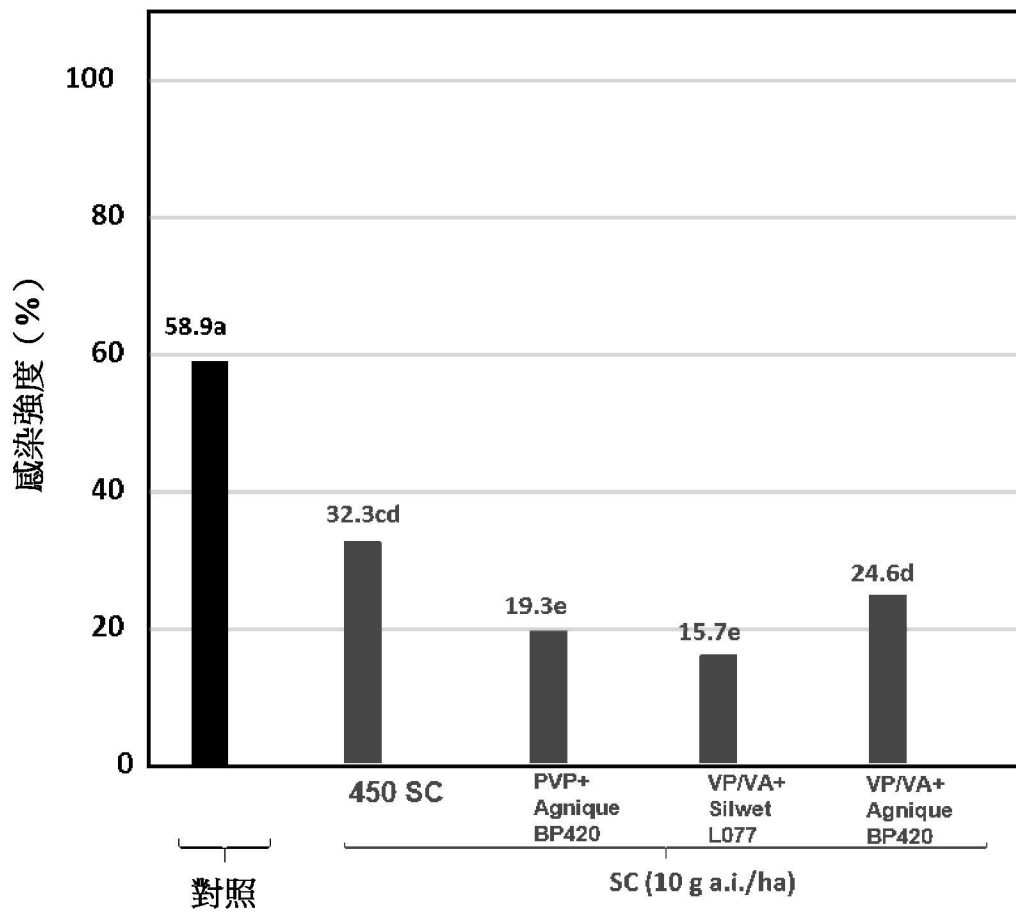
【圖2】



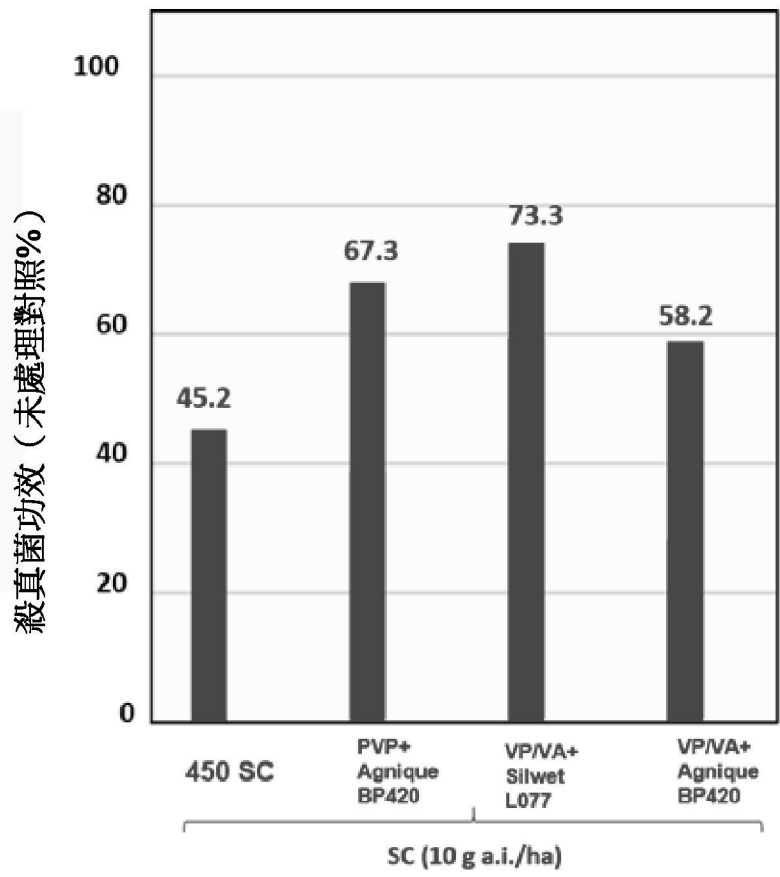
【圖3】



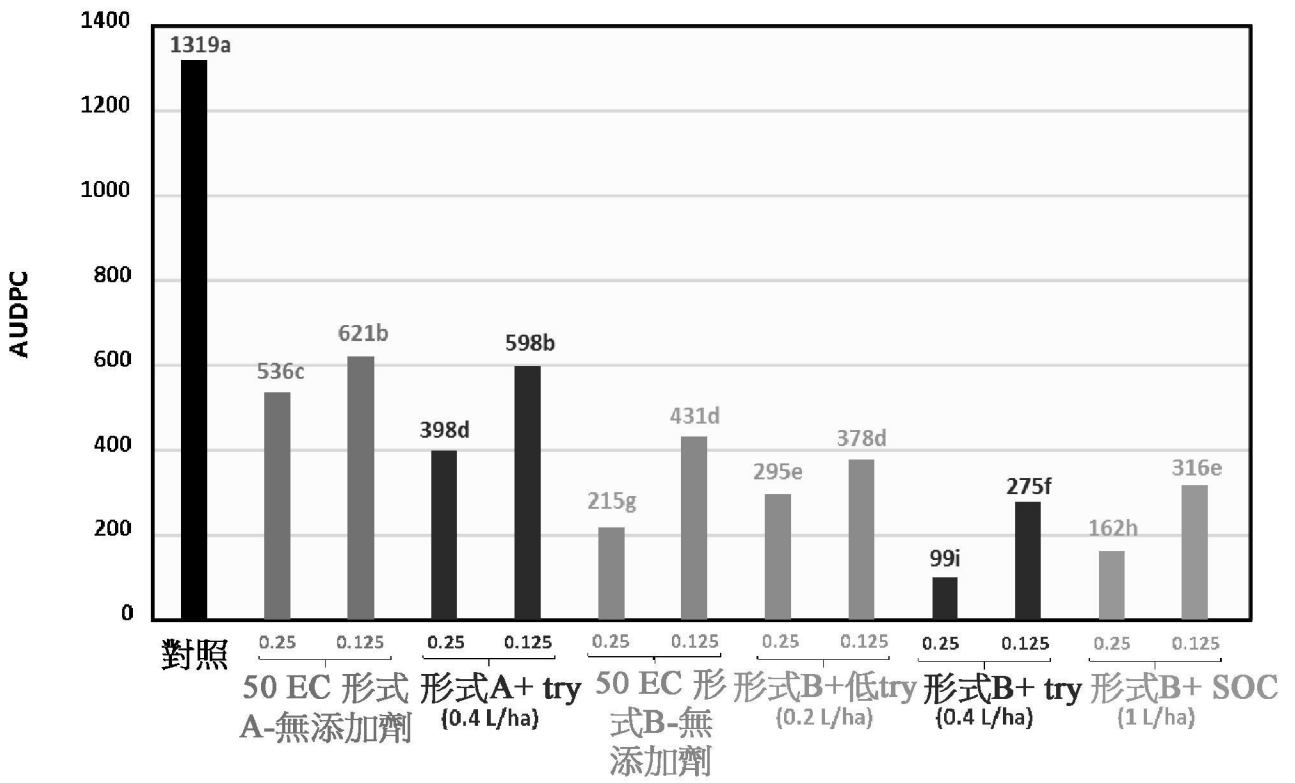
【圖4】



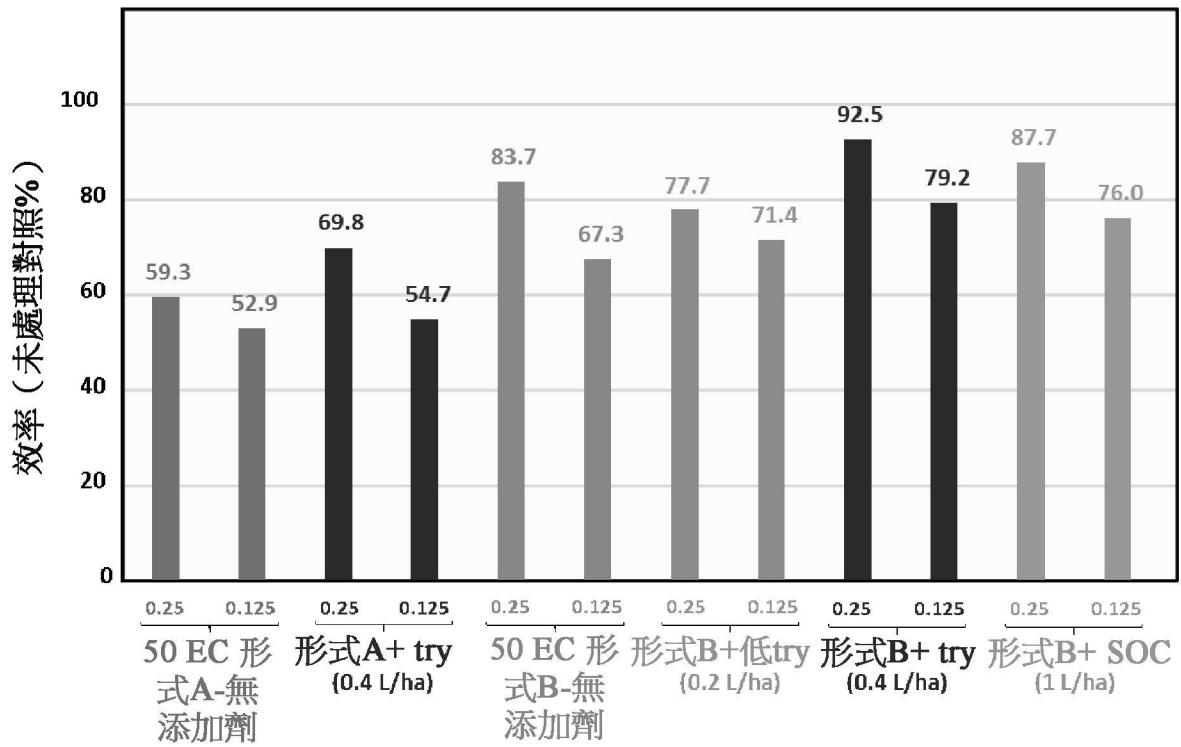
【圖5】



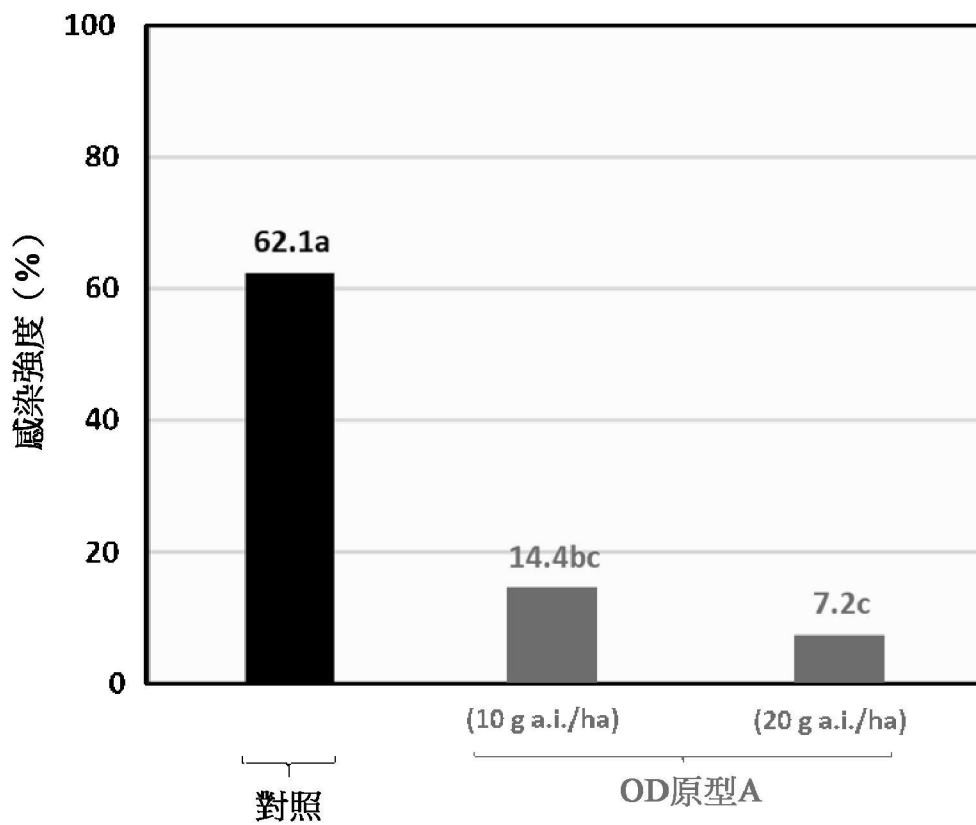
【圖6】



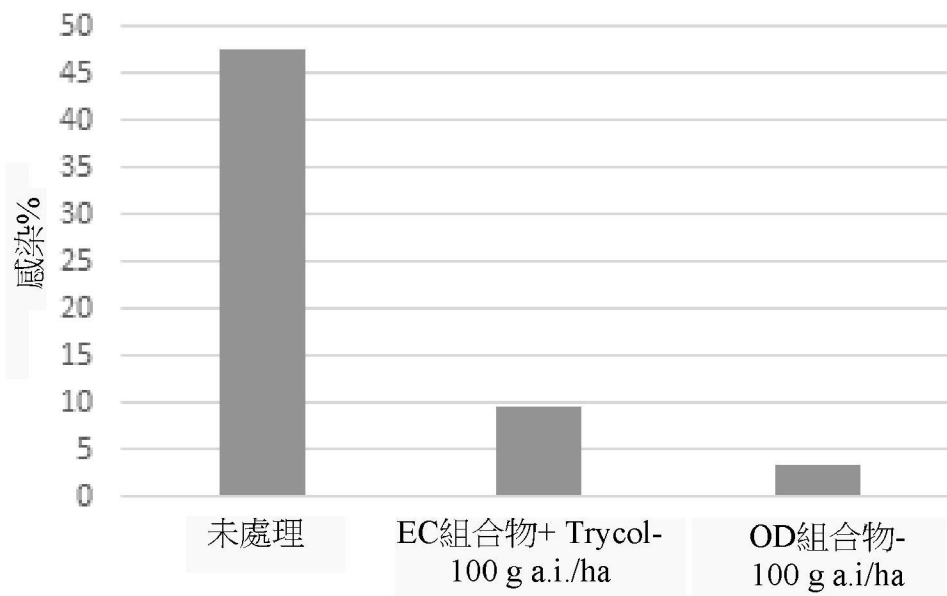
【圖7】



【圖8】



【圖9】

馬鈴薯晚疫病（致病疫黴（*Phytophthora infestans*））

【圖10】