



(21) 申請案號：107134486

(22) 申請日：中華民國 107 (2018) 年 09 月 28 日

(51) Int. Cl.:

A01N43/90 (2006.01)

A01P7/04 (2006.01)

(71) 申請人：德商巴地斯顏料化工廠 (德國) BASF SE (DE)

德國

(72) 發明人：迪克豪特 裘秦 DICKHAUT, JOACHIM (DE)；黃 華章 HUANG, HUAZHANG

(CN)；曼昂 安尼爾 C MENON, ANIL C (US)

(74) 代理人：陳長文

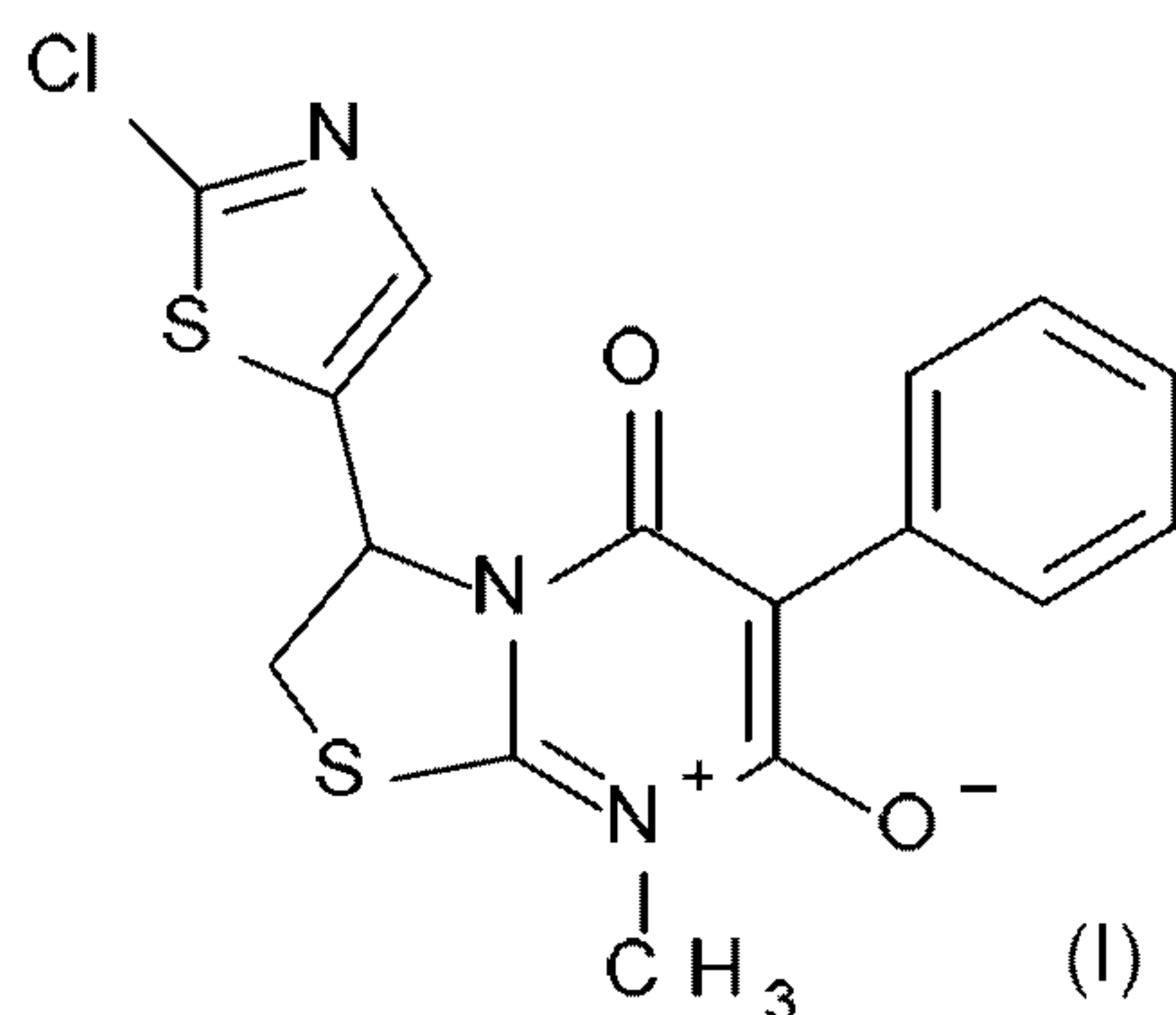
申請實體審查：無 申請專利範圍項數：17 項 圖式數：0 共 81 頁

(54) 名稱

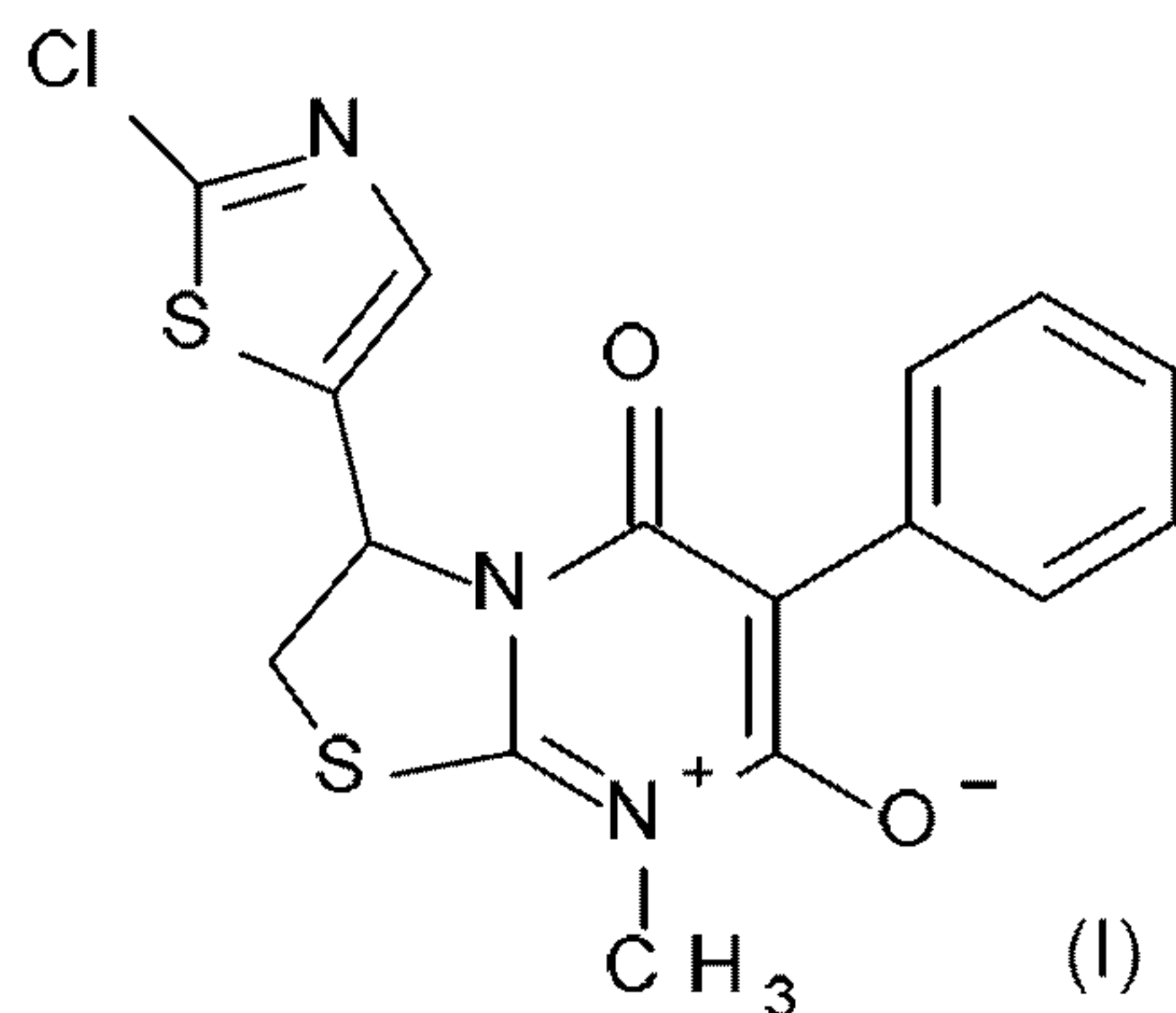
用於控制稻中的稻有害生物之方法

(57) 摘要

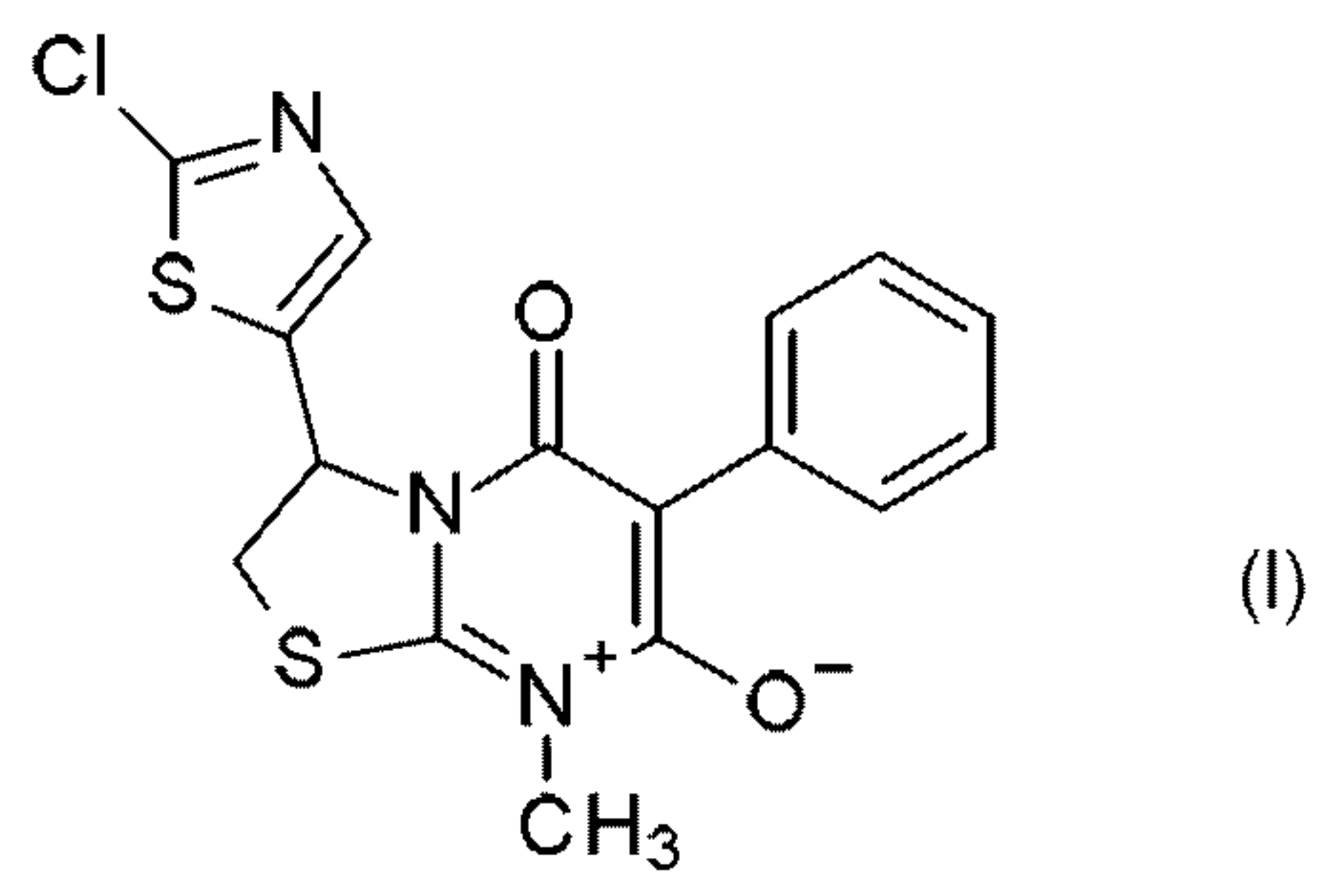
本發明係關於用於控制稻有害無脊椎動物之方法，該等方法包含藉由秧苗盒施用來施用式(I)之嘧啶鎘化合物、其立體異構體、鹽、互變異構體及 N-氧化物、其混合物及包含此類化合物或混合物之組合物。



The present invention relates to methods for controlling rice pest invertebrates, which methods comprise applying pyrimidinium compounds of formula (I), the stereoisomers, salts, tautomers and N-oxides thereof, their mixtures and compositions comprising such compounds or mixtures, by seedling box application.



特徵化學式：





202011813

【發明摘要】

【中文發明名稱】

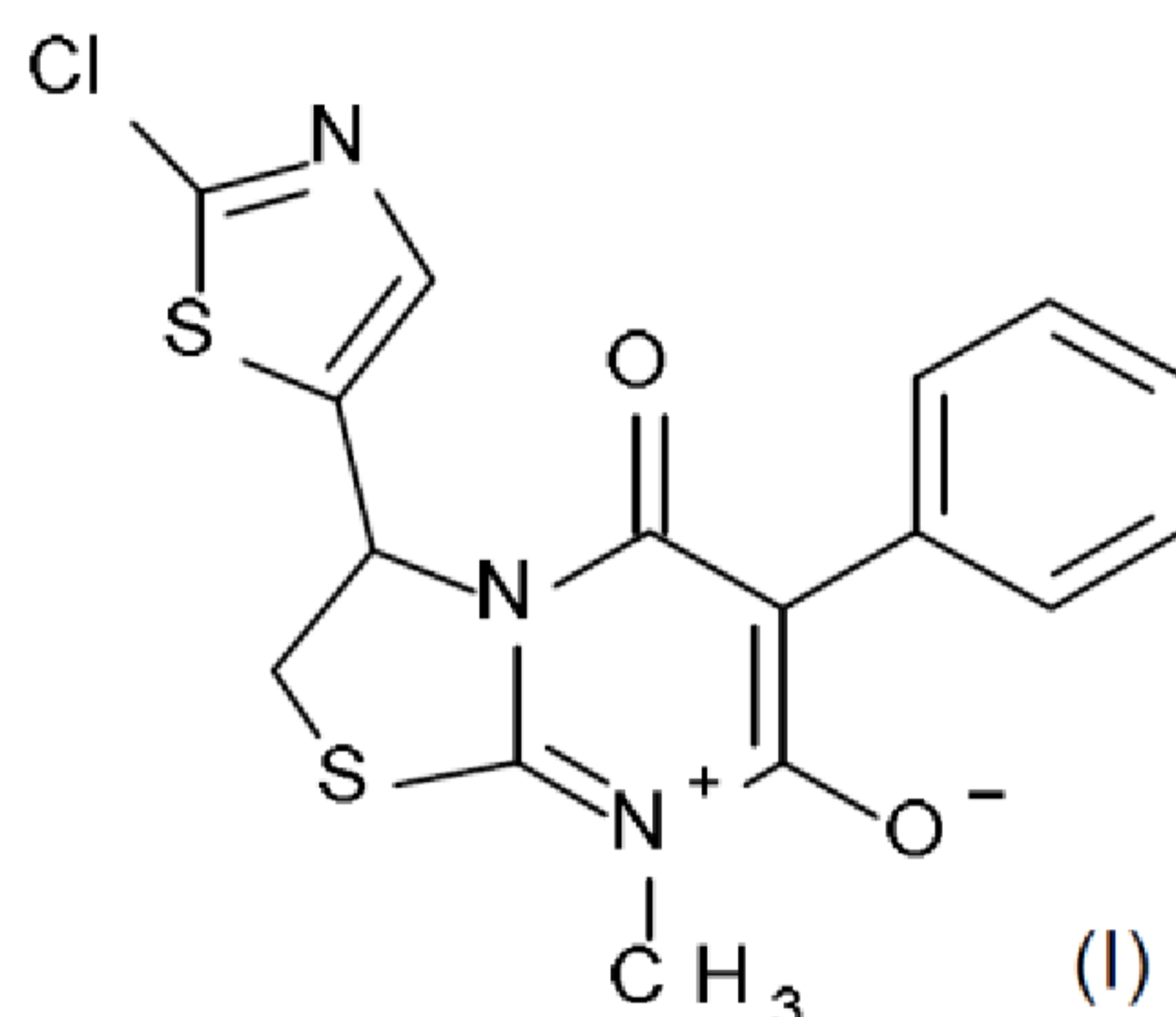
用於控制稻中的稻有害生物之方法

【英文發明名稱】

METHOD OF CONTROLLING RICE PESTS IN RICE

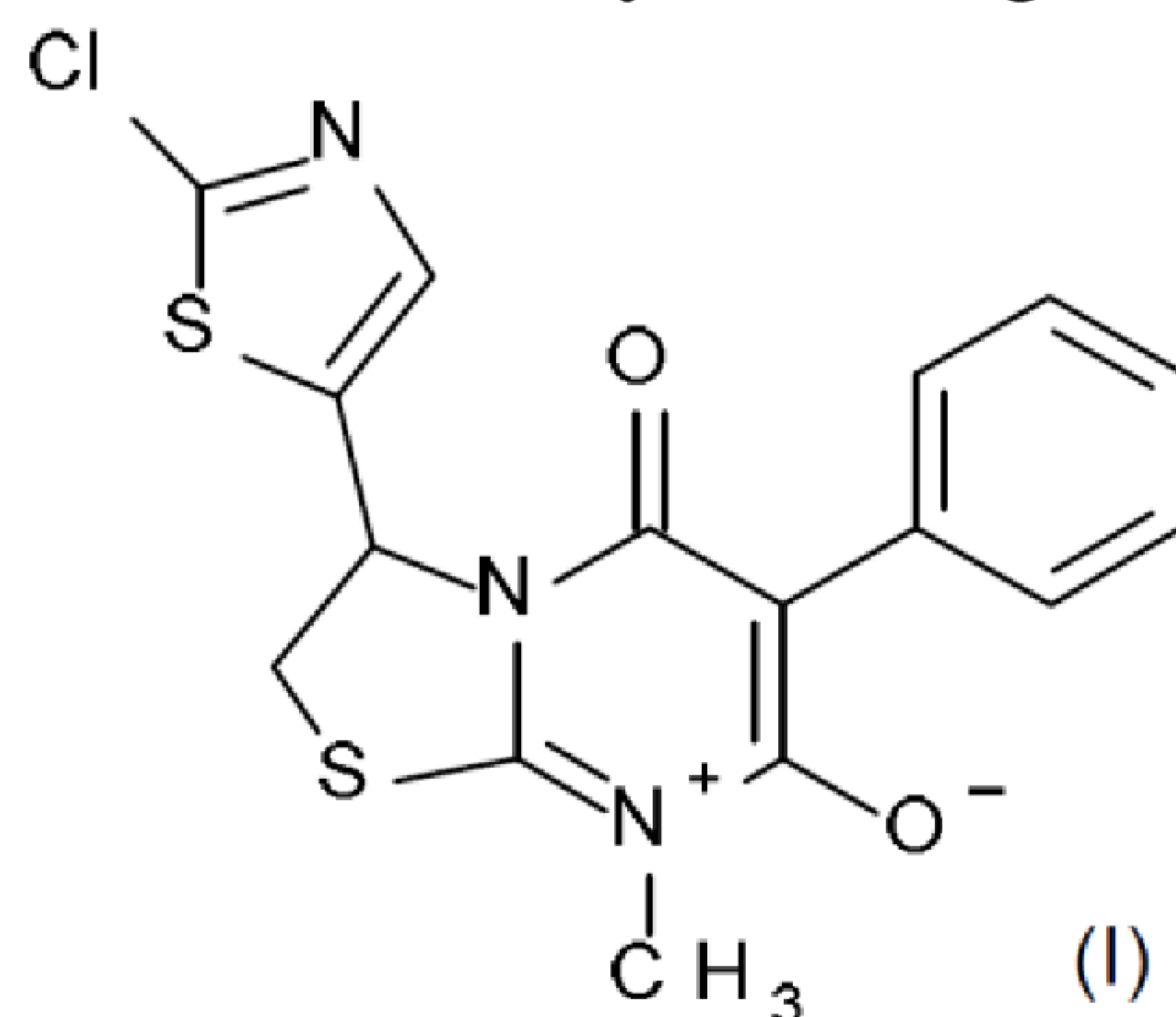
【中文】

本發明係關於用於控制稻有害無脊椎動物之方法，該等方法包含藉由秧苗盒施用來施用式(I)之嘧啶鎬化合物、其立體異構體、鹽、互變異構體及N-氧化物、其混合物及包含此類化合物或混合物之組合物。



【英文】

The present invention relates to methods for controlling rice pest invertebrates, which methods comprise applying pyrimidinium compounds of formula (I), the stereoisomers, salts, tautomers and N-oxides thereof, their mixtures and compositions comprising such compounds or mixtures, by seedling box application.



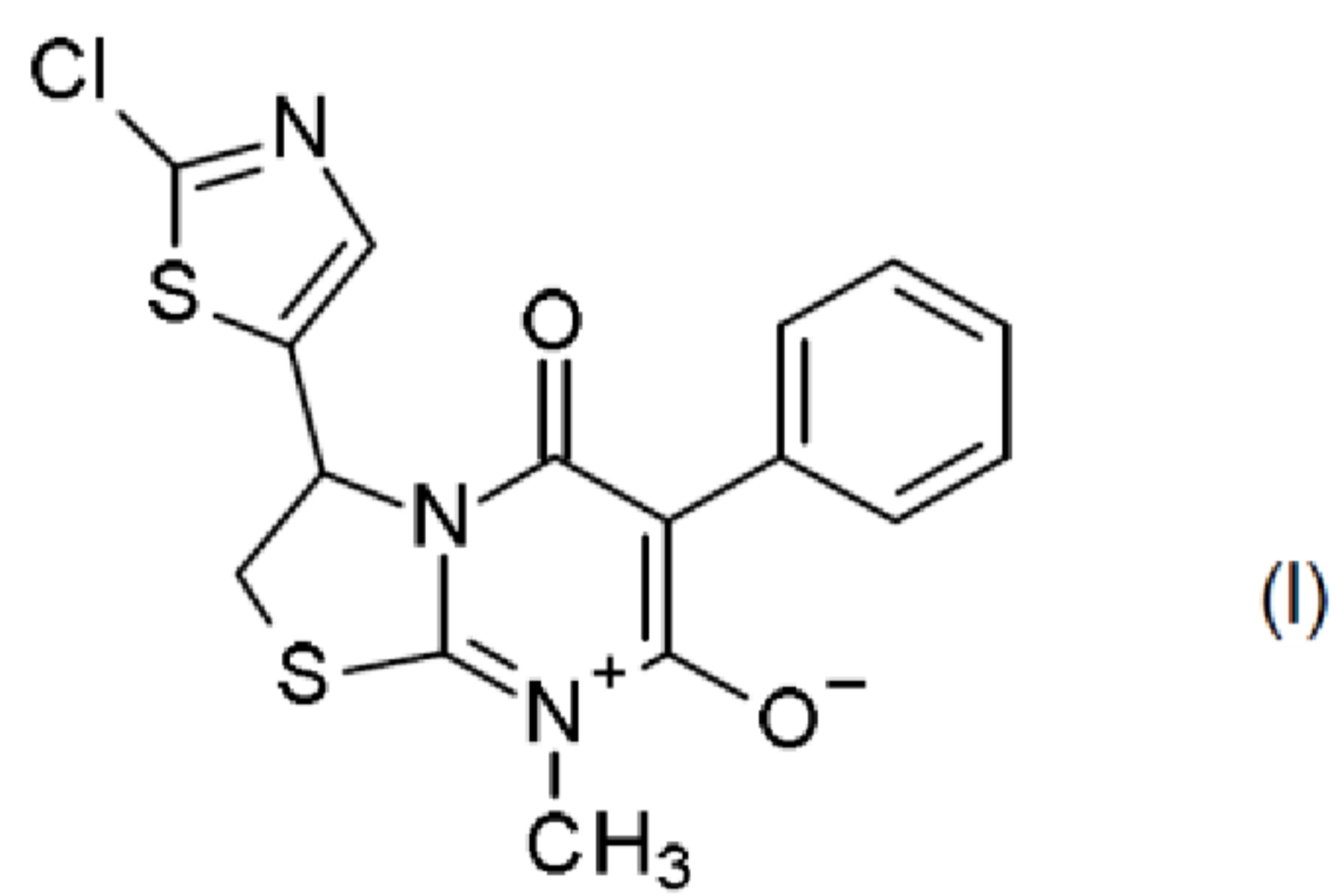
【指定代表圖】

無

【代表圖之符號簡單說明】

無

【特徵化學式】



【發明說明書】

【中文發明名稱】

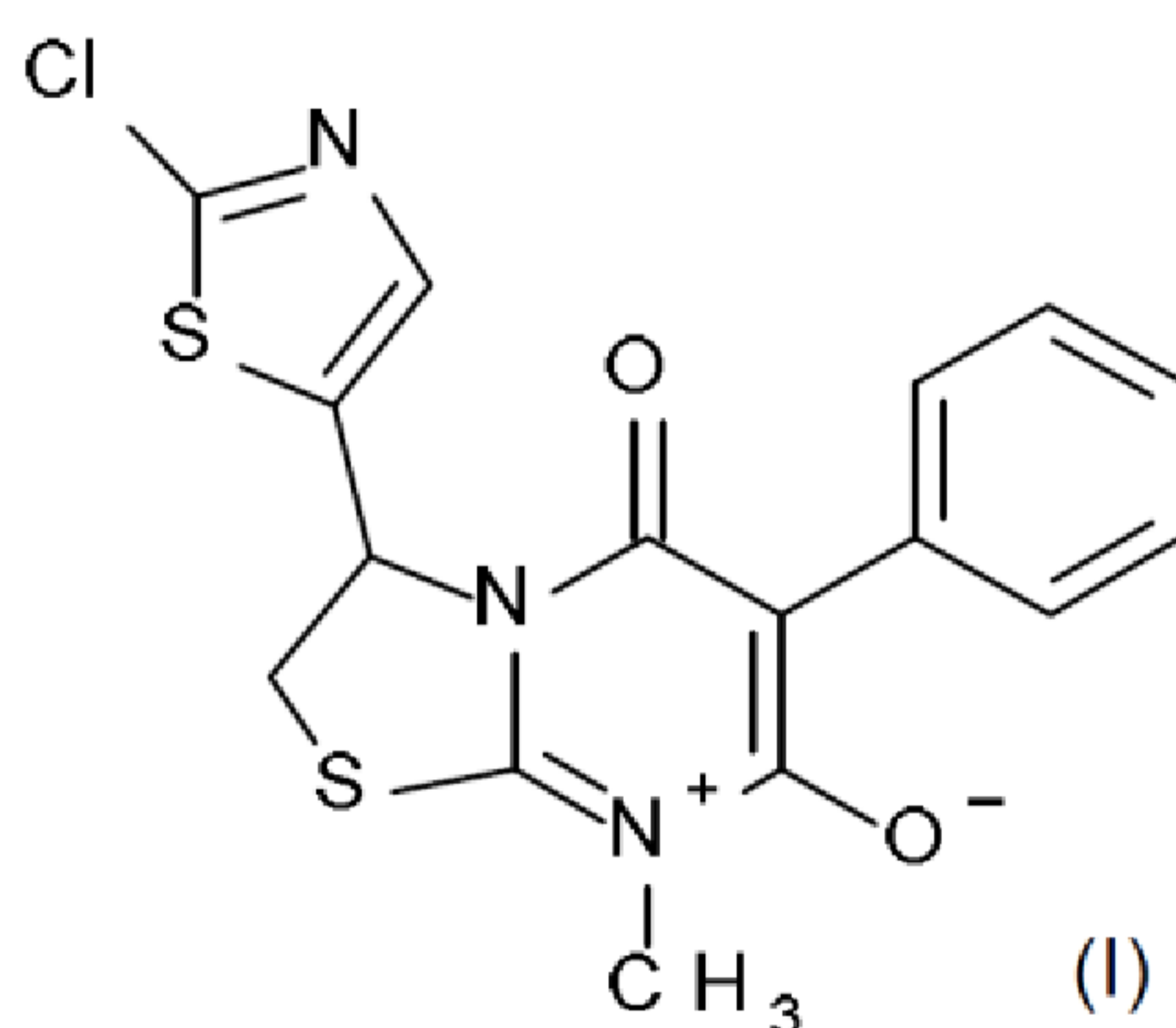
用於控制稻中的稻有害生物之方法

【英文發明名稱】

METHOD OF CONTROLLING RICE PESTS IN RICE

【技術領域】

【0001】 本發明係關於用於控制稻有害無脊椎動物之方法，該等方法包含藉由秧苗盒施用來施用式(I)之嘧啶鎘化合物、其立體異構體、鹽、互變異構體及N-氧化物、其混合物及包含此類化合物或混合物之組合物。



【先前技術】

【0002】 稻(稻屬物種，尤其稻(*Oryza sativa*))為世界上一種重要的基本食物。其為亞洲之主食且為許多文化之重要組成部分。因此，稻為一種重要的作物且大面積栽培，尤其在亞洲。

【0003】 無脊椎有害生物，尤其昆蟲、節肢動物及線蟲對生長及收穫的稻作物造成顯著損害，從而對食物供應及財產造成巨大的經濟損失。雖然已知大量殺有害生物劑，但由於目標有害生物對該等試劑產生抗性之能力，因此一直需要用於對抗無脊椎有害生物諸如昆蟲、蛛形綱動物及線蟲的新試劑。另外，稻栽培需要適於稻種植方法(例如使用育苗盒)、稻

田、水生環境等等之特殊殺有害生物劑。適用於稻之殺有害生物劑亦必須被稻植物很好地耐受。其亦必須被稻植物之環境很好地耐受，例如根據生態毒理學之觀點，亦即其必須不損害有益生物體。另外，其必須經受住施用其之條件以確保功效。此舉在稻通常生長之水生環境及高溫氣候條件中尤其是一個挑戰。另一方面，其必須在合理的時間段內降解，以使其不會對環境具有任何負面影響。其不得影響農民及消費者之健康。其以後不應存在於稻產品中(低殘留或無殘留)，以確保食用稻之人類的安全。此外，許多有害生物已對稻中常用之殺有害生物劑產生抗性。因此，適用於稻之殺有害生物劑應有效針對已對對之耐藥性殺有害生物劑產生抗性之彼等有害生物。並非所有殺有害生物劑均能夠滿足在此等條件下使用之要求。

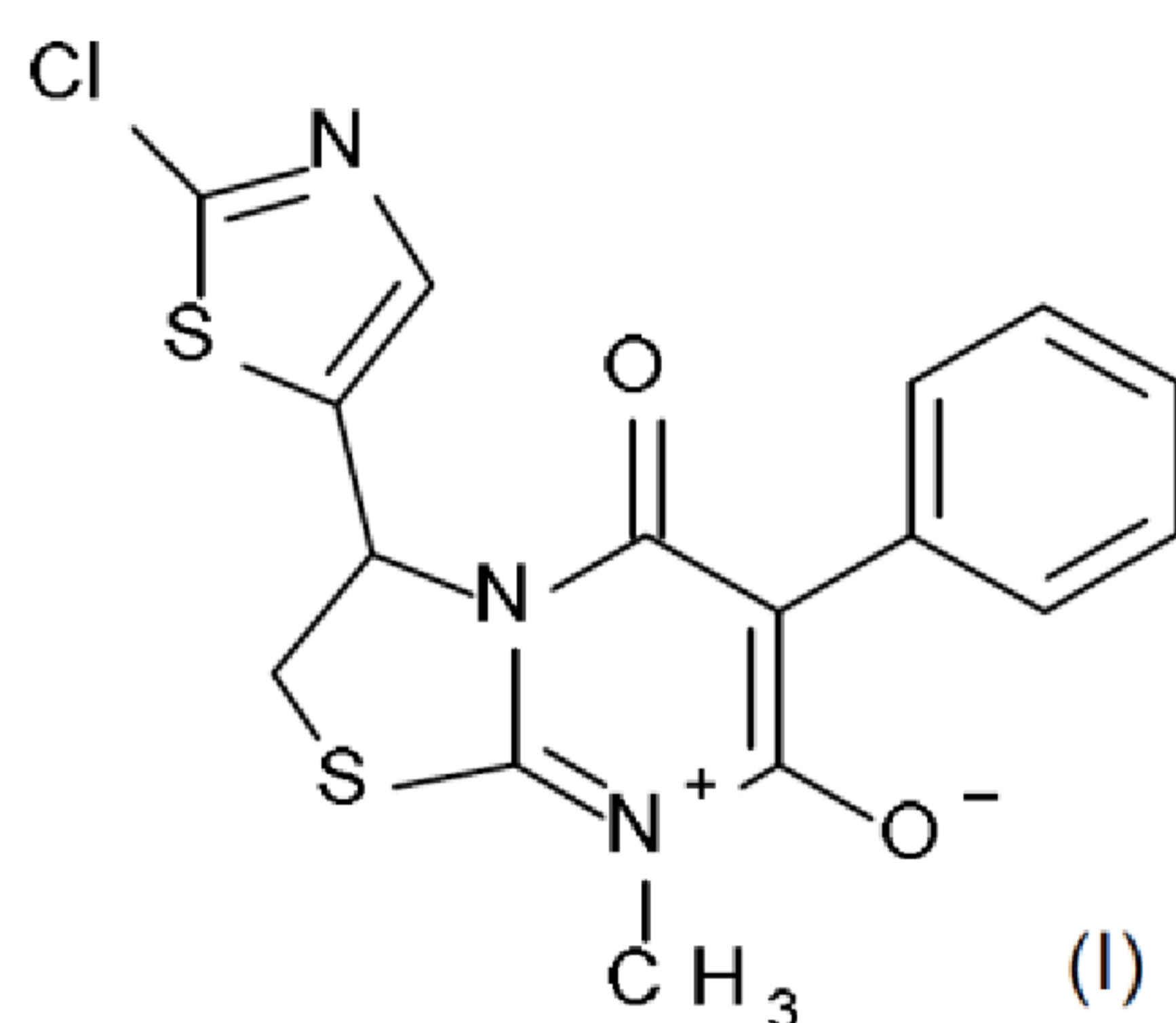
【發明內容】

【0004】 因此，本發明之一個目的為提供具有良好殺有害生物活性且顯示出對稻中出現之大量不同無脊椎有害生物，尤其對難以控制之昆蟲、蛛形綱動物及線蟲之良好活性譜，同時仍顯示出良好的調節概況的化合物。

【實施方式】

【0005】 已發現，此等目的可藉由如下文所定義之通式(I)之含S噁啶鎘化合物，包括其立體異構體，其鹽，特別是其農業上或獸醫學上可接受之鹽，其互變異構體及其N-氧化物來達成。

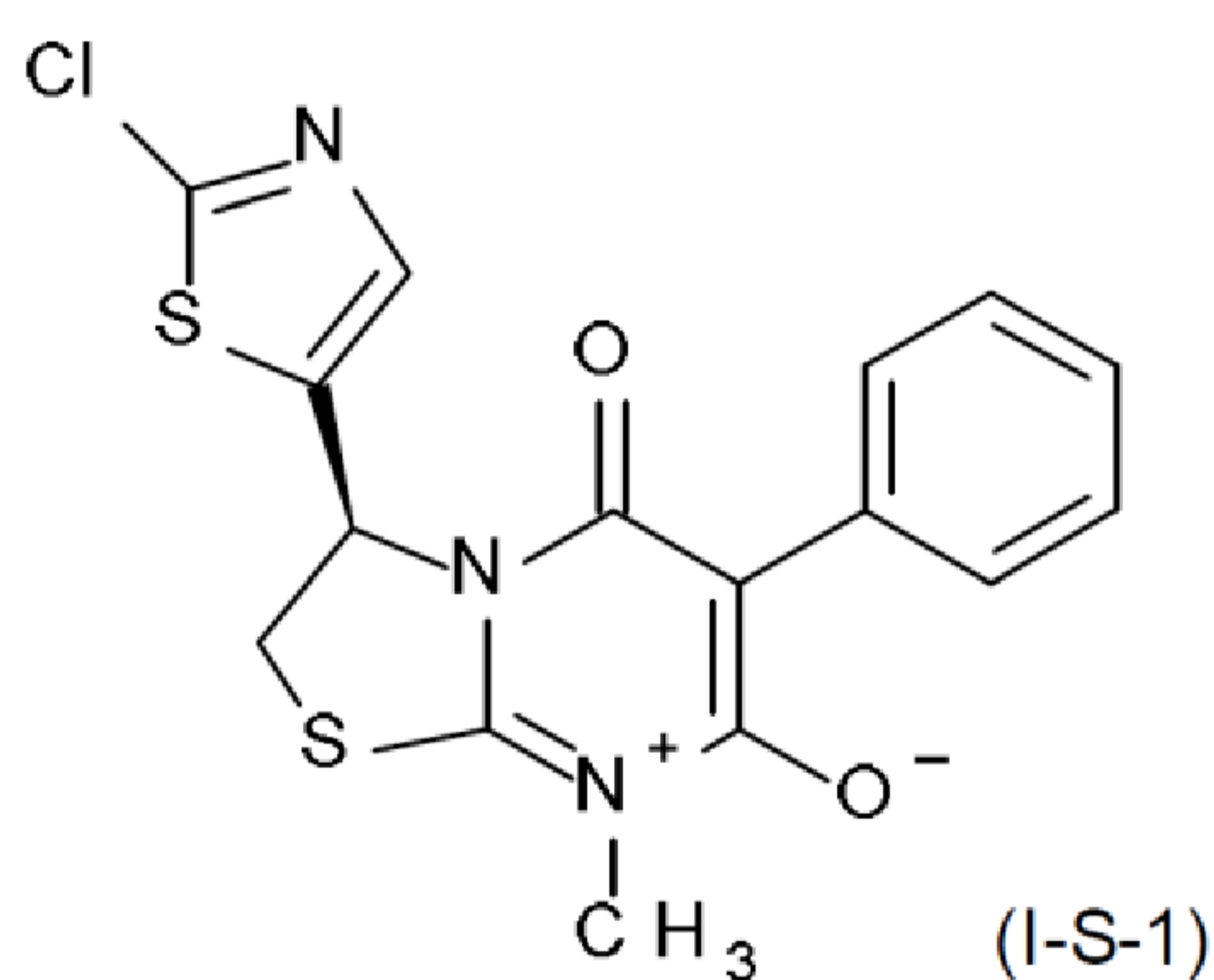
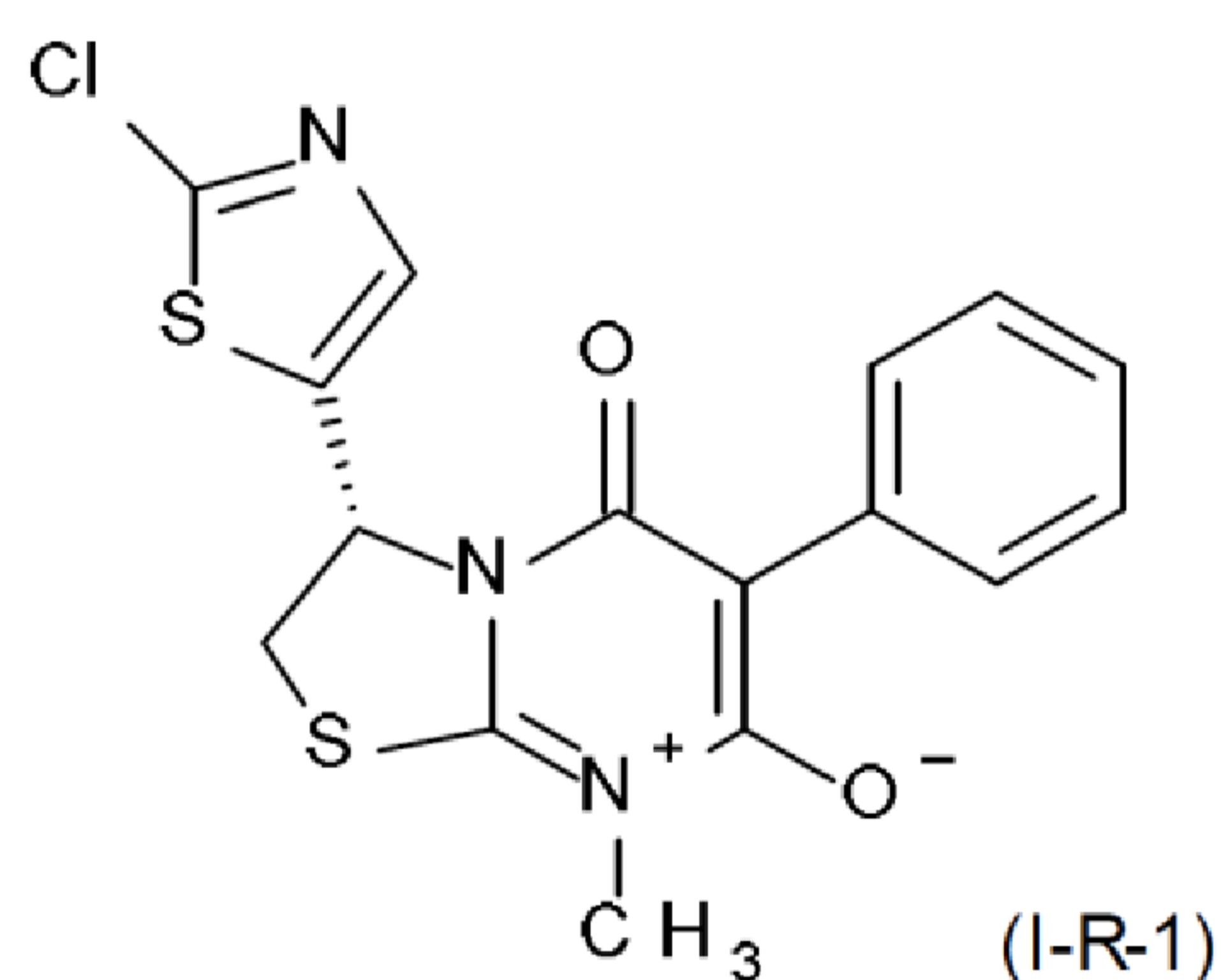
【0006】 在第一態樣中，本發明係關於一種控制稻中之稻有害無脊椎動物之秧苗盒施用方法，該方法包含向該等稻有害無脊椎動物施用式(I)化合物



【0007】 在另一態樣中，本發明係關於一種控制稻中之稻有害無脊椎動物的方法，該方法包含藉由秧苗盒施用向該等稻有害無脊椎動物施用式(I)化合物。

【0008】 WO 2014/167084 及 PCT/EP2018/057578 描述某些經取代之嘧啶鎊化合物，其具有用於對抗無脊椎有害生物之雜環取代基。

【0009】 式(I)化合物以兩種對映異構體形式 I-R-1 及 I-S-1 存在，如下所示



【0010】 此外，本發明係關於且包括以下實施例：

- 式(I)化合物，其用於藉由秧苗盒施用來控制稻中之稻有害生物，尤其稻有害無脊椎動物；
- 包含式(I)化合物之組合物，其用於藉由秧苗盒施用來控制稻中之稻有害生物，尤其稻有害無脊椎動物；
- 包含一定量的如上文所定義之式(I)化合物或其對映異構體、非對映異構體或鹽之農業組合物，其用於藉由秧苗盒施用來控制稻中之稻有害

生物，尤其稻有害無脊椎動物；

- 一種用於對抗稻有害無脊椎動物、受稻有害無脊椎動物侵染或感染之方法，該方法包含藉由秧苗盒施用向該有害生物或其食物供應地、棲息地或繁殖地施用殺有害生物有效量之如上文所定義之式(I)化合物或其組合物；

- 一種用於控制稻有害無脊椎動物、受無脊椎有害生物侵染或感染之方法，該方法包含藉由秧苗盒施用向該有害生物或其食物供應地、棲息地或繁殖地施用殺有害生物有效量之如上文所定義之式(I)或包含式(I)化合物之組合物；

- 一種針對稻有害無脊椎動物之預防或保護方法，其包含藉由秧苗盒施用使稻有害無脊椎動物或其食物供應地、棲息地或繁殖地與如上文所定義之式(I)化合物或包含如上文所定義之式(I)化合物的組合物或包含式(I)化合物之組合物接觸；

- 一種用於保護稻、稻植物、稻植物繁殖材料及/或生長的稻植物免受稻有害無脊椎動物侵襲或侵染之方法，其包含藉由秧苗盒施用而用殺有害生物有效量之如上文所定義之式(I)化合物或包含式(I)化合物之組合物接觸或處理稻、稻植物、稻植物繁殖材料及生長的稻植物，或稻、稻植物、稻植物繁殖材料儲存或稻植物生長的土壤、材料、表面、空間、區域或水；

- 一種用於增加尤其稻田中之稻植物之健康的方法，其包含藉由秧苗盒施用而用式(I)化合物處理；

- 一種用於增加稻植物之產量的方法，其包含用式(I)化合物處理。

【0011】 此外，本發明係關於且包括以下實施例：

- 式(I)化合物，其用於秧苗盒施用，用於控制稻中之稻有害生物，尤其稻有害無脊椎動物；
- 包含式(I)化合物之秧苗盒，其用於控制稻中之稻有害生物，尤其稻有害無脊椎動物；
- 包含式(I)化合物之育苗盒，其用於控制稻中之稻有害生物，尤其稻有害無脊椎動物；
- 包含農業組合物之秧苗盒施用方法，該等農業組合物包含一定量的如上文所定義之式(I)化合物或其對映異構體、非對映異構體或鹽，用於控制稻中之稻有害生物，尤其稻有害無脊椎動物；
- 一種用於對抗稻有害無脊椎動物、受稻有害無脊椎動物侵染或感染之秧苗盒施用方法，該方法包含使該有害生物或其食物供應地、棲息地或繁殖地與殺有害生物有效量之如上文所定義之式(I)化合物或其組合物接觸；
- 一種用於控制稻有害無脊椎動物、受無脊椎有害生物侵染或感染之秧苗盒施用方法，該方法包含使該有害生物或其食物供應地、棲息地或繁殖地與殺有害生物有效量之如上文所定義之式(I)化合物或包含式(I)化合物之組合物接觸；
- 一種針對稻有害無脊椎動物之用於預防或保護之秧苗盒施用方法，其包含使稻有害無脊椎動物或其食物供應地、棲息地或繁殖地與如上文所定義之式(I)化合物或包含如上文所定義之式(I)化合物的組合物或包含式(I)化合物之組合物接觸；
- 一種用於保護稻、稻植物、稻植物繁殖材料及/或生長的稻植物免受稻有害無脊椎動物侵襲或侵染的秧苗盒施用方法，其包含用殺有害生物

有效量之如上文所定義之式(I)化合物或包含式(I)化合物之組合物接觸或處理稻、稻植物、稻植物繁殖材料及生長的稻植物，或稻、稻植物、稻植物繁殖材料儲存或稻植物生長的土壤、材料、表面、空間、區域或水；

- 一種用於增加尤其稻田中之稻植物之健康的秧苗盒施用方法，其包含用式(I)化合物處理；

- 一種用於增加稻植物之產量的秧苗盒施用方法，其包含用式(I)化合物處理。

【0012】 本發明係關於育苗盒，其包含稻、稻種子之生長基質及用於處理該等稻種子以長時間保護稻植物免遭昆蟲之式(I)化合物的水性調配物。本發明進一步關於一種使用含有式(I)化合物之殺昆蟲產品處理稻作物的新方法，且更尤其關於一種處理稻作物抵抗稱為螟蟲(禾草螟屬(*Chilo spp.*))及飛虱(褐稻虱(*Nilparvata lugens*))之寄生蟲以及諸如象鼻蟲(稻象甲(*Lissorhoptrus oryzophilus*))之其他寄生蟲的新方法。其他寄生蟲宜藉由本發明方法消除，尤其線蟲葉芽線蟲(*Aphelenoides besseyi*)及潛蠅菲律賓稻毛眼水蠅(*Hydrellia philippina*)。

【0013】 稻作物受許多疾病攻擊，尤其受昆蟲(諸如上述昆蟲)攻擊。在稻米之情況下，消除此等昆蟲極其困難，因為可能的處理產品往往會污染稻田中的水。因此，研究旨在有效及有力地處理稻植物抵抗寄生蟲，同時將水污染降至最低限度。解決此問題之困難特別大，因為兩個需求彼此衝突：若減少處理次數以減少污染，則保護品質會降低。若增加處理次數以提高保護品質，則污染亦增加。因此，對於有待解決之問題沒有明顯的解決方案，因為唯一可能的解決方案彼此衝突。

【0014】 在稻栽培之情況下避免水污染的問題更加困難，因為用於

稻栽培之水包含各種物種，包括有益及可營利的有用昆蟲或水生動物。必須在不損害此等可營利的物種的情況下毀滅有害物種。

【0015】 儘管市場上及文獻中可獲得的殺昆蟲劑非常多，但對上述問題幾乎沒有令人滿意的解決方案。

【0016】 現已發現一種根據灌溉稻之方法種植稻秧苗的新方法，其可解決全部或部分上述問題。

【0017】 根據本發明之另一態樣，後者係關於一種處理稻植物或稻繁殖材料以抵抗昆蟲之方法，以便在播種期後獲得對植物持續及有效的保護，其特徵在於向該等植物或較佳向其繁殖材料施用有效量之式I化合物。更佳地，所用繁殖材料為稻種子或換言之，稻粒。有利地，使用的殺昆蟲材料將在下文定義。

【0018】 此外，本發明係關於且包括以下實施例：

- 包含式(I)化合物及稻種子之秧苗盒；
- 包含農業組合物之秧苗盒，其包含一定量的如上文所定義之式(I)化合物或其對映異構體、非對映異構體或鹽；
- 包含式(I)化合物之秧苗盒，其中浸漬於稻種子中之式(I)化合物之量為約3至200 g/q，較佳約3至100 g/q，更佳約6至25 g/q。

【0019】 本發明之所有化合物，包括其立體異構體、其互變異構體、其鹽或其N-氧化物以及其組合物，特別適用於控制無脊椎稻有害生物，特別是用於控制節肢動物及線蟲以及尤其昆蟲。因此，本發明係關於如本發明所揭示之化合物用於藉由秧苗盒施用來對抗或控制無脊椎稻有害生物，特別是昆蟲、蛛形綱動物或線蟲之群之無脊椎有害生物的用途。

【0020】 術語「秧苗盒施用」係指在移栽於主要田地之前，在育苗

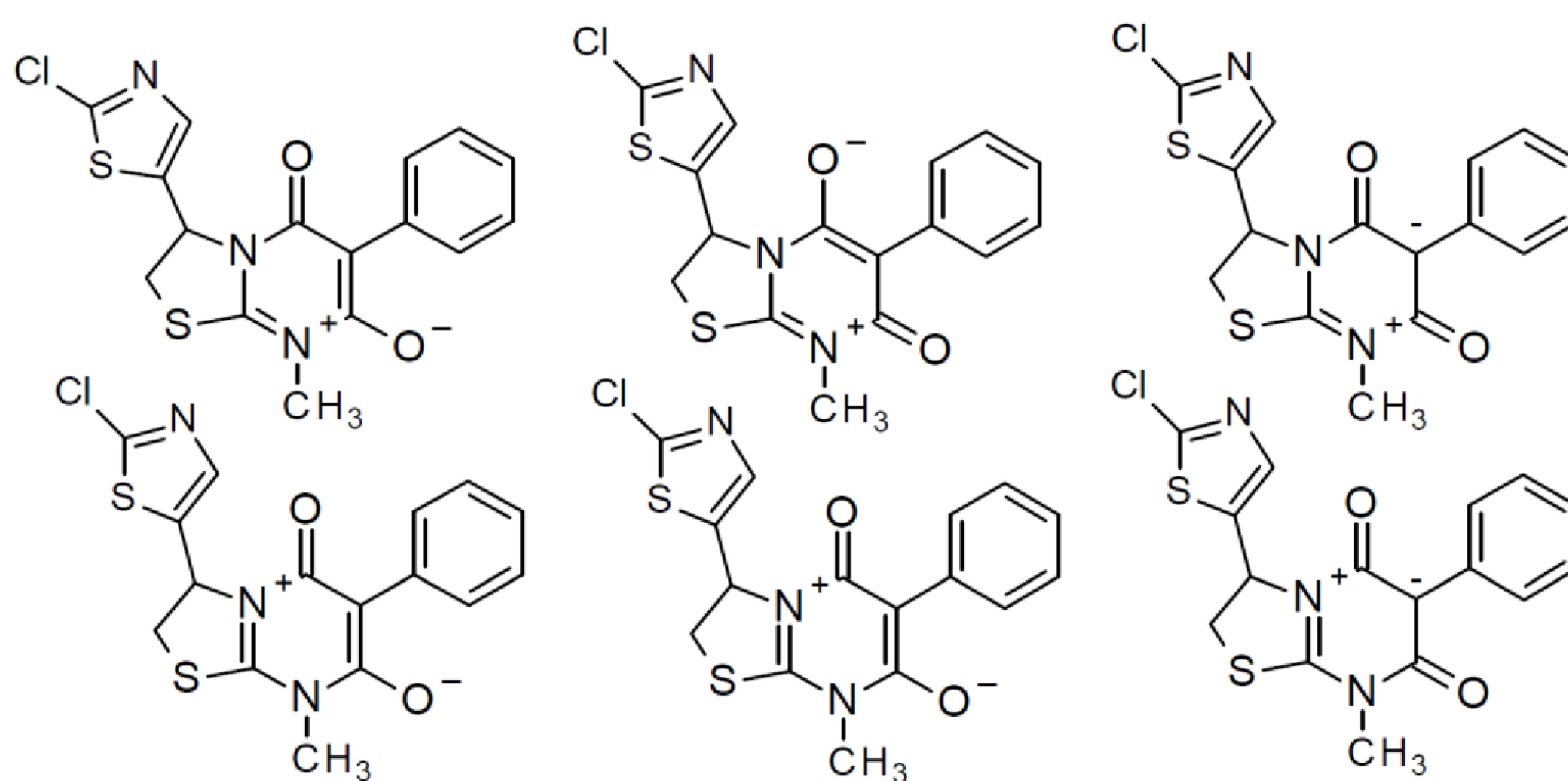
盒或含有稻秧苗之秧苗盒中人工或機械併入殺昆蟲劑調配物(例如顆粒劑、液體)。

【0021】 如本發明中所用之術語「根據本發明之化合物」或「式(I)化合物」或「化合物I或(I)」係指且包含如本文所定義之化合物及/或其立體異構體、鹽、互變異構體或N-氧化物。術語「本發明之化合物」應理解為等同於術語「根據本發明之化合物」，因此亦包含式(I)化合物之立體異構體、鹽、互變異構體或N-氧化物。

【0022】 術語「本發明方法」或根據本發明之方法」係指如本文所述之秧苗盒施用方法。

【0023】 術語「根據本發明之組合物」或「本發明之組合物」涵蓋包含如上文所定義之根據本發明之式(I)化合物的組合物，因此亦包括式(I)化合物之立體異構體、農業上或獸醫學上可接受之鹽、互變異構體或N-氧化物。

【0024】 式(I)化合物以內消旋形式存在。此等形式可以不同的等電子式表示，其各自在不同的原子上具有形式正電荷及負電荷(如下所示)。本發明擴展至式I化合物之所有代表性等電子結構。



【0025】 式I-R-1及I-S-1化合物亦以類似於如上所示之式I化合物的

內消旋形式存在。

【0026】 式(I)化合物以對映異構體或非對映異構體之混合物形式存在。本發明提供式(I)化合物之單一純對映異構體或純非對映異構體及其混合物，以及式(I)化合物之純對映異構體或純非對映異構體或其混合物之根據本發明的用途。

【0027】 術語「立體異構體」涵蓋光學異構體，諸如對映異構體或非對映異構體，後者由於分子中多於一個對掌性中心而存在，以及幾何異構體(順/反異構體)。本發明係關於式(I)化合物之每一可能的立體異構體，亦即單一對映異構體或非對映異構體以及其混合物。下文更詳細地描述特定對映異構體的較佳實施例，如式(I-R-1)及(I-S-1)之化合物。

【0028】 式(I)化合物之鹽較佳為農業上及/或獸醫學上可接受之鹽。其可以習用方法形式，例如若式(I)化合物具有鹼性官能基，則藉由使化合物與所討論之陰離子的酸反應，或藉由使式(I)之酸性化合物與適合之鹼反應。

【0029】 適合之農業上或獸醫學上有用之鹽尤其為彼等陽離子之鹽或彼等酸之酸加成鹽，其陽離子及陰離子分別對根據本發明之化合物的作用沒有任何不利影響。適合之陽離子具體為鹼金屬，較佳鋰、鈉及鉀；鹼土金屬，較佳鈣、鎂及鋇；及過渡金屬，較佳錳、銅、鋅及鐵之離子，以及銨(NH₄⁺)及經取代之銨，其中一至四個氫原子經C₁-C₄烷基、C₁-C₄羥基烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷氧基-C₁-C₄烷基、羥基-C₁-C₄烷氧基-C₁-C₄烷基、苯基或苯甲基置換。經取代之銨離子的實例包含甲基銨、異丙基銨、二甲基銨、二異丙基銨、三甲基銨、四甲基銨、四乙基銨、四丁基銨、2-羥基乙基銨、2-(2-羥基乙氧基)乙基銨、雙(2-羥乙基)銨、苯甲基

三甲基銨及苯甲基三乙基銨，此外，鎘離子、銻離子，較佳三(C₁-C₄烷基)銻，及氧化銻離子，較佳三(C₁-C₄烷基)氧化銻。

【0030】 有用的酸加成鹽的陰離子主要為氯離子、溴離子、氟離子、硫酸氫根、硫酸根、磷酸二氫根、磷酸氫根、磷酸根、硝酸根、碳酸氫根、碳酸根、六氟矽酸根、六氟磷酸根、苯甲酸根及C₁-C₄烷酸之陰離子，較佳甲酸根、乙酸根、乙二酸根及丁酸根。其可藉由使式I化合物與相應陰離子之酸，較佳鹽酸、氫溴酸、硫酸、磷酸或硝酸反應來形成。

【0031】 術語「N-氧化物」包括具有至少一個氧化成N-氧化物部分之三級氮原子的任何本發明化合物。

【0032】 式(I)化合物可如WO2014/167084及EP17164175.6中所述製備。上述式(I)化合物之製備可使其以異構體混合物形式獲得。若需要，其可藉由習用於此目的之方法解析，諸如結晶或層析，亦可對光學活性吸附物解析，得到純的異構體。

【0033】 化合物I之農藝學上可接受之鹽可以習用方式形成，例如藉由與所討論之陰離子的酸反應。

【0034】

優先選擇

在一個特定態樣中，本發明係關於如本文所述之控制稻中之稻有害無脊椎動物的秧苗盒施用方法，其中式(I)化合物為化合物I-R-1、其鹽或N-氧化物。

【0035】 在一個特定態樣中，本發明係關於藉由如本文所述之秧苗盒施用來控制稻中之稻有害無脊椎動物的方法，其中式(I)化合物為化合物I-R-1、其鹽或N-氧化物。

【0036】 在本發明之另一個實施例中，式(I)化合物為化合物I-S-1。

【0037】

稻有害生物

在本發明之上下文中，稻有害無脊椎動物為在稻中出現的動物有害生物。稻有害無脊椎動物包括昆蟲、蟎蟲及線蟲，較佳昆蟲。稻中熟知的稻有害無脊椎動物包括但不限於以下物種：

半翅目：

褐飛虱 - 褐稻虱(*Nilaparvata lugens*)

灰飛虱 - 斑飛虱(*Laodelphax striatellus*)

白背飛虱 - 白背飛虱(*Sogatella furcifera*)

白葉蟬 - 白翅褐脈葉蟬(*Cofana spectra*)

青葉蟬 - 二點黑尾葉蟬(*Nephotettix virescens*)、黑條黑尾葉蟬(*N. nigriceps*)、黑尾葉蟬(*N. cincticeps*)、馬來亞黑尾葉蟬(*N. malayanus*)

電光葉蟬 - 電光葉蟬(*Recilia dorsalis*)

玉米橙葉蟬 - 二星葉蟬(*Cicadulina bipunctata*)

紫莞葉蟬 - 紫莞點葉蟬(*Macrosteles fascifrons*)

稻穗蝽，大稻緣蝽(*Leptocorisa oratorius*)，稻蛛緣蝽(*L. acuta*)

稻褐蝽 - 稻綠蝽(*Nezara viridula*)、異曼蝽(*Pygomenida varipennis*)、二星蝽屬(*Eysarcoris*)、*Tibraca limbatriventris*、廣二星蝽(*Eysarcoris ventralis*)

小臭蟲 - 雜色稻椿(*Oebalus poecilus*)、美洲稻椿(*O. pugnax*)

緣蝽 - 二星蝽屬

長蝽 - 麥長蝽(*Blissus leucopterus leucopterus*)

水稻粉蚧，水稻粉紅粉蚧(*Brevennis rehi*)，亞蔗粉蚧(*Pseudococcus saccharicola*)

稻蚜，紅腹縊管蚜(*Rhopalosiphum rufiabdominalis*)，麥長管蚜(*Macrosiphum avenae*)，無肘詠蚜(*Hysteroneura setariae*)，黑腹四脈綿蚜(*Tetraneuro nigriabdominalis*)

菜豆根蚜 - 棉根蚜(*Smynthuodes betae*)

鱗翅目：

稻苞蟲 - 直紋稻弄蝶(*Parnara guttata*)、暮眼蝶(*Melanitis Ieda ismene*)

水稻螟蟲/條螟 - 二化螟(*Chilo suppressalis*)、黑頭條紋螟(*Chilo polychrusus*)、斑禾草螟(*Chilo partellus*)、七星稻螟(*Chilo plejadellus*)

稻稈螟 - 稻多麗螟(*Chilotraea polychrysa*)

大螟 - 大螟(*Sesamia inferens*)

三化螟 - 三化螟(*Tryporyza (=Scirpophaga) incertulas*)

稻白螟 - 稻白螟(*Tryporyza innotata*)

稻縱卷葉螟/卷葉蟲 - 稻縱卷葉野螟(*Cnaphalocrocis medinalis*)、寬紋刷鬚野螟(*Marasmia patnalis*)、稻顯紋刷鬚野螟(*M. exigua*)

刺枝蟲/行軍蟲- 東方黏蟲(*Pseudaletia separate*)

綠毛蟲 - 犁紋黃夜蛾(*Xanthodes transversa*)

稻綠毛蟲 - 稻螟蛉(*Narnaga aenescens*)

綠角毛蟲 - 暮眼蝶、眉眼蝶屬(*Mycalesis sp*)

草地黏蟲 - 草地貪夜蛾(*Spodoptera frugiperda*)

切根蟲 - 黏蟲(*Mythimna separata*)

稻殼蟲- 稻三點螟(*Nymphula depunctalis*)

黑毛毛蟲，鹿蛾屬(*Amata* sp.)

長毛毛蟲- 實毛脛裳蛾(*Mocis frugalis*)

黃毛蟲，鉤茸毒蛾(*Psalis pennatula*)

水稻半褐尺蠖，實毛脛裳蛾

水稻擬尺蠖，金色雙斑蛾(*Chrysodeixis chalcites*)

草螟 - 水稻切葉野螟(*Herpetogramma licarsisalis*)

蔗螟 - 小蔗螟(*Diatraea saccharalis*)

玉米稈螟 - 南美玉米苗斑螟(*Elasmopalpus lignosellus*)

條紋草尺蠖 - 南美毛脛夜蛾(*Mocis latipes*)

歐洲玉米螟 - 玉米螟(*Ostrinia nubilalis*)

墨西哥稻螟 - 墨西哥水稻螟(*Eoreuma loftini*)

鞘翅目：

水稻象鼻蟲 - 稻水象甲(*Lissorhopterus oryzophilus*)

稻象鼻蟲 - 稻象甲(*Echinocnemus squamous*)

米象 - 水稻負泥蟲(*Oryzophagus oryzae*)

水稻鐵甲蟲 - 水稻鐵甲(*Diclodispa armigera*)

水稻葉甲 - 稻葉甲(*Oulema oryzae*)

稻黑蝽 - 稻黑蝽(*Scotinophora vermidulate*、*S. vermidulate*、*S. lurida*)、寬翅黑蝽(*S. latiuscula*)

水稻跳甲 - 黑凹脛跳甲(*Chaetocnima basalis*)

蛆 - 白鱗鰓金龜(*Leucopholis irrorata*)、白鱗鰓金龜、鰓角金龜屬(*Phyllophaga* sp)、異爪犀金龜屬(*Heteronychus* sp)

金龜子 - 阿根廷兜蟲(*Diloboderus abderus*)

象鼻蟲 - 尖隱喙象屬(*Sphenophorus* spp)

葡萄鞘葉甲 - 葡萄鞘葉甲(*Colaspis brunnea*)、路易斯安那葉甲(*C. louisianae*)

水稻花粉甲蟲，花金龜(*Chilolaba acuta*)

雙翅目：

稈蠅 - 稻稈潛蠅(*Chlorops oryzae*)

潛蠅 - 日本稻潛蠅(*Agromyza oryzae*)

稻水蠅/稻稈蠅 - 稻莖毛眼水蠅(*Hydrellia sasakii*)

稻水蠅/稻小潛蠅 - 稻潛葉蠅(*Hydrellia griseola*)

稻癭蚊 - 稻癭蚊(*Orseolia (=Pachydiplosis) oryzae*)

秧苗蠅- 稻芒蠅(*Atherigona oryzae*)

稻搖蚊 - *Chironomus cavazzai*、搖蚊屬(*Chironomus* spp)、環足搖蚊屬(*Cricotopus* spp)

纓翅目：

稻薊馬 - 稻薊馬 (*Chloethrips oryzae*)、稻直鬃薊馬 (*Stenochaetothrips biformis*)、裸薊馬屬(*Perrisothrips* sp.)、器管薊馬屬 (*Hoplothrips* sp.)，

直翅目：

稻蝗、等岐蔗蝗(*Hieroglyphus banian*)、高粱蔗蝗(*Hieroglyphus nigrorepletus*)、紅褐斑腿蝗 (*Catantops pinguis*)、紡梭負蝗 (*Attractomorpha burri*)、短翅負蝗(*A. crenulate*)、柳枝負蝗(*A. psittacina psittacina*)、尖頭負蝗(*A. Bedeli*)、無齒稻蝗(*Oxya adenttata*)、*Oxya*

ebneri、小稻蝗(*Oxya hyla intricata*)、長頭蝗(*Acrida turricata*)

蝗蟲 - 東亞飛蝗(*Locusta migratoria manilensis*)

螻蛄，非洲螻蛄(*Grylotalpa africana*)

蟋蟀：雙斑蟋(*Gryllus bimaculatus*)、烏頭眉紋蟋蟀(*Teleogryllus occipitalis*)、靈巧纖蟋(*Euscyrtus concinus*)

蝻斯 - 長翅草蝻(*Conocephalus longipennis*)

等翅目：

白蟻 - 暗黃大白蟻(*Macrotermes gilvus*)、*Syntermes molestans*

膜翅目：

螞蟻 - 熱帶火蟻(*Solenopsis geminata*)

稻幹尖線蟲 - 葉芽線蟲(*Aphelenchoides besseyi*)

蜉蝣亞綱：

稻穗蟎 - 稻細蟎(*Steotarsonemus pinki*)

甲殼綱：

鬻蟲 - 佳朋鬻蟲(*Triops longicaudatus*)、蟹形鬻蟲(*T. cancriformis*)

水稻小龍蝦 - 克氏原螯蝦(*Procambarus clarkii*)、莫里斯綠螯蝦(*Orconectes virilis*)。

【0038】另外，水稻受一系列臭蟲(包括中華稻緣蝽(*Leptocorisa chinensis*)、稻褐蝽(*Lagynotomus elongates*)、稻綠蝽(*Nerzara viridula*)、尖角二星蝽(*Eysacoris parvus*)、大稻緣蝽、美洲稻蝽(*Oebalus pugnax*)、長肩棘緣蝽(*Cletus trigonus*))以及各種蟎蟲、毛蟲、甲蟲、根蟲及蛆蟲侵襲。

【0039】在一個實施例中，稻有害無脊椎動物為噬咬/咀嚼昆蟲。

【0040】 在一個實施例中，稻有害無脊椎動物為刺/吸昆蟲。

【0041】 在一個實施例中，稻有害無脊椎動物為銼式昆蟲。

【0042】 在一個實施例中，稻有害無脊椎動物為虹吸昆蟲。

【0043】 在一個實施例中，稻有害無脊椎動物為舔吸昆蟲。

【0044】 在一個實施例中，稻有害無脊椎動物係選自褐飛虱(褐稻虱)、灰飛虱(斑飛虱)、白背飛虱(白背飛虱)、水稻螟蟲/條螟(二化螟)、三化螟(三化螟)、稻縱卷葉螟/卷葉蟲(稻縱卷葉野螟)、水稻象鼻蟲(稻水象甲)。

【0045】 在一個實施例中，稻有害無脊椎動物來自半翅目或鱗翅目。

【0046】 在一個實施例中，稻有害無脊椎動物來自半翅目。在另一個實施例中，稻有害無脊椎動物為跳蟲，較佳選自褐飛虱(褐稻虱)、灰飛虱(斑飛虱)、白背飛虱(白背飛虱)、青葉蟬(二點黑尾葉蟬)。在另一個實施例中，稻有害無脊椎動物係選自褐飛虱(褐稻虱)及青葉蟬(二點黑尾葉蟬)，較佳為褐飛虱(褐稻虱)。

【0047】 在一個實施例中，稻有害無脊椎動物為褐飛虱(褐稻虱)。

【0048】 在一個實施例中，稻有害無脊椎動物為青葉蟬(二點黑尾葉蟬)。

【0049】 在另一個實施例中，稻有害無脊椎動物為臭蟲，較佳選自稻褐蝽(稻綠蝽、異曼蝽、二星蝽屬、*Tibraca limbatriventris*、廣二星蝽)或小臭蟲(雜色稻椿、美洲稻椿)。

【0050】 在一個實施例中，稻有害無脊椎動物來自鱗翅目。在另一個實施例中，稻有害無脊椎動物為螟蟲，較佳為莖螟蟲，較佳為水稻螟蟲

(二化螟)或三化螟(三化螟)。

【0051】 在另一個實施例中，稻有害無脊椎動物為稻縱卷葉螟/卷葉蟲(稻縱卷葉野螟、寬紋刷鬚野螟、稻顯紋刷鬚野螟)。

【0052】 在一個實施例中，稻有害無脊椎動物來自鞘翅目。在另一個實施例中，稻有害無脊椎動物為水稻象鼻蟲(稻水象甲)。在另一個實施例中，稻有害無脊椎動物為米象(水稻負泥蟲)。

【0053】 在一個實施例中，稻有害無脊椎動物來自白蟻科(等翅目)。

【0054】 在一個較佳實施例中，稻有害無脊椎動物為稻象甲。

【0055】 本發明亦關於根據本發明之方法，其施用至少一種本發明之化合物與至少一種如下文所定義之混合搭配物的混合物。較佳為作為組分I之一種本發明化合物與作為組分II之如下文所定義之一種混合搭配物的二元混合物。此類二元混合物之較佳重量比為5000:1至1:5000，較佳1000:1至1:1000，更佳100:1至1:100，尤其較佳10:1至1:10。在此類二元混合物中，組分I及II可以等量使用，或者可使用過量的組分I或過量的組分II。

【0056】 混合搭配物可選自殺有害生物劑，尤其殺昆蟲劑、殺線蟲劑及殺蟎劑、殺真菌劑、除草劑、植物生長調節因子、肥料及其類似物。較佳混合搭配物為殺昆蟲劑、殺線蟲劑及殺真菌劑。

【0057】 以下根據殺昆蟲劑抗性行動委員會(Insecticide Resistance Action Committee, IRAC)之作用分類模式分組及編號，可與本發明化合物一起使用且可產生潛在的協同效應的殺有害生物劑之清單M意欲說明可能的組合，但不強加任何限制：

M.1 乙醯膽鹼酯酶(AChE)抑制劑：M.1A 胺基甲酸酯類，例如得滅克 (aldicarb)、棉靈威 (alanycarb)、惡蟲威 (bendiocarb)、免扶克 (benfuracarb)、丁酮威 (butocarboxim)、丁酮砒威 (butoxycarboxim)、加保利 (carbaryl)、加保扶 (carbofuran)、丁基加保扶 (carbosulfan)、殺蟲丹 (ethiofencarb)、仲丁威 (fenobucarb)、複滅蟎 (formetanate)、呋線威 (furathiocarb)、葉蟬散 (isoprocarb)、滅賜克 (methiocarb)、納乃得 (methomyl)、速滅威 (metolcarb)、歐殺滅 (oxamyl)、比加普 (pirimicarb)、安丹 (propoxur)、硫敵克 (thiodicarb)、久效威 (thiofanox)、混滅威 (trimethacarb)、XMC、滅殺威 (xylylcarb) 及啞蚜威 (triazamate)；或 M.1B 有機磷酸酯類，例如歐殺松 (acephate)、亞滅松 (azamethiphos)、乙基穀速松 (azinphos-ethyl)、甲基穀速松 (azinphosmethyl)、硫線磷 (cadusafos)、氯氧磷 (chlorethoxyfos)、克芬松 (chlorfenvinphos)、氯甲磷 (chlormephos)、陶斯松 (chlorpyrifos)、甲基陶斯松 (chlorpyrifos-methyl)、蠅毒磷 (coumaphos)、殺螟腈 (cyanophos)、甲基硫代內吸磷 (demeton-S-methyl)、大利松 (diazinon)、二氯松 (dichlorvos)/DDVP、雙特松 (dicrotophos)、大滅松 (dimethoate)、甲基毒蟲畏 (dimethylvinphos)、二硫松 (disulfoton)、EPN、愛殺松 (ethion)、普伏松 (ethoprophos)、氨磺磷 (famphur)、芬滅松 (fenamiphos)、撲滅松 (fenitrothion)、芬殺松 (fenthion)、噻啞磷 (fosthiazate)、庚烯磷 (heptenophos)、新菸磷 (imicyafos)、異柳磷 (isofenphos)、O-(甲氧基-胺基硫基-磷醯基)水楊酸異丙酯、加福松 (isoxathion)、馬拉硫磷 (malathion)、滅蚜磷 (mecarbam)、達馬松 (methamidophos)、滅大松 (methidathion)、美文松 (mevinphos)、亞素靈

(monocrotophos)、二溴磷(naled)、氧樂果(omethoate)、甲基滅多松(oxydemeton-methyl)、巴拉松(parathion)、甲基巴拉松(parathion-methyl)、賽達松(phenthoate)、福瑞松(phorate)、裕必松(phosalone)、益滅松(phosmet)、福賜米松(phosphamidon)、巴賽松(phoxim)、甲基亞特松(pirimiphos-methyl)、布飛松(profenofos)、巴胺磷(propetamphos)、普硫松(prothiofos)、吡啶硫磷(pyraclofos)、嗒嗒硫磷(pyridaphenthion)、喹惡磷(quinalphos)、治螟磷(sulfotep)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、雙硫磷(temephos)、託福松(terbufos)、樂本松(tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷(thiometon)、三落松(triazophos)、三氯松(trichlorfon)及蚜滅多(vamidothion)；

M.2. GABA閘控氯離子通道拮抗劑：M.2A環戊二烯有機氯化物，例如安殺番(endosulfan)或氯丹(chlordane)；或M.2B苯基吡啶類(fiproles)(phenylpyrazoles)，例如乙蟲清(ethiprole)、氟蟲腓(fipronil)、丁蟲腓(flufiprole)、吡嗒氟蟲腓(pyrafluprole)及派瑞樂(pyriprole)；

M.3 M.3A擬除蟲菊酯類鈉通道調節劑，例如阿納寧(acrinathrin)、丙烯除蟲菊酯(allethrin)、d-順-反丙烯除蟲菊酯、d-反丙烯除蟲菊酯、畢芬寧(bifenthrin) (尤其 κ -畢芬寧)、百亞列寧(bioallethrin)、百亞列寧S-環戊烯基、苜呋菊酯(bioresmethrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、 β -賽扶寧、賽洛寧(cyhalothrin)、 λ -賽洛寧、 γ -賽洛寧、賽滅寧(cypermethrin)、 α -賽滅寧、 β -賽滅寧、 θ -賽滅寧、 ζ -賽滅寧、賽酚寧(cyphenothrin)、第滅寧(deltamethrin)、烯炔菊酯(empenthrin)、益化利(esfenvalerate)、依芬寧(etofenprox)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、護賽寧(flucythrinate)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、 τ -福化

利(tau-fluvalinate)、苜蟎醚(halfenprox)、七氟甲醚菊酯(heptafluthrin)、依普寧(imiprothrin)、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、甲氧苄氟菊酯(metofluthrin)、沫氟寧(momfluorothrin) (尤其 ϵ -沫氟寧)、百滅寧(permethrin)、苯醚菊酯(phenothrin)、普亞列寧(prallethrin)、丙氟菊酯(profluthrin)、必列寧(pyrethrin)(除蟲菊(pyrethrum))、列滅寧(resmethrin)、矽護芬(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin) (尤其 κ -七氟菊酯)、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)、治滅寧(tetramethrin)、泰滅寧(tralomethrin)及拜富寧(transfluthrin)；或M.3B鈉通道調節劑,諸如DDT或甲氧滴滴涕(methoxychlor)；

M.4 菸鹼乙醯膽鹼受體促效劑(nAChR)：M.4A新菸鹼類似物(neonicotinoids)，例如啞蟲脒(acetamiprid)、噁蟲胺 clothianidin)、環氧蟲啉(cycloxaprid)、呋蟲胺(dinotefuran)、吡蟲啉(imidacloprid)、烯啞蟲胺(nitenpyram)、噁蟲啉(thiacloprid)及噁蟲嗪(thiamethoxam)；或化合物M.4A.1 4,5-二氫-N-硝基-1-(2-環氧乙烷基甲基)-1H-咪唑-2-胺，M.4A.2：(2E-)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-N'-硝基-2-亞戊脒甲脒；或M4.A.3：1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-7-甲基-8-硝基-5-丙氧基-1,2,3,5,6,7-六氫咪唑并[1,2-a]吡啶；或M.4B菸鹼；M.4C氟啞蟲胺脞(sulfoxaflor)；M.4D 氟吡呋喃酮(flupyradifurone)；M.4E 三氟苯嘧啶(triflumezopyrim)；

M.5 菸鹼乙醯膽鹼受體異位活化劑：多殺黴素類(spinosyns)，例如賜諾殺(spinosad)或賜諾特(spinetoram)；

M.6 阿維菌素類(avermectins)及米爾倍黴素類(milbemycins)之氯離子通道活化劑，例如阿巴汀(abamectin)、因滅汀(emamectin benzoate)、

伊維菌素(ivermectin)、雷皮菌素(lepimectin)或密滅汀(milbemectin)；

M.7 保幼激素模擬物，諸如M.7A保幼激素類似物烯蟲乙酯(hydroprene)、烯蟲炔酯(kinoprene)及美賜平(methoprene)；或M.7B芬諾克(fenoxycarb)，或M.7C百利普芬(pyriproxyfen)；

M.8 各種非特異性(多位點)抑制劑，例如M.8A烷基鹵化物，如溴化甲烷及其他烷基鹵化物，M.8B氯化苦(chloropicrin)，M.8C硫醯氟，M.8D硼砂或M.8E吐酒石(tartar emetic)；

M.9 弦音器TRPV通道調節劑，例如M.9B派滅淨(pymetrozine)；吡啶啉(pyriproxyfen)；

M.10 蟎生長抑制劑，例如M.10A克芬蟎(clofentezine)、合賽多(hexythiazox)及氟蟎嗪(diflovidazin)，或M.10B依殺蟎(etoxazole)；

M.12 粒線體ATP合成酶抑制劑，例如M.12A汰芬諾克(diafenthiuron)或M.12B有機錫殺壁蟲劑，諸如三唑錫(azocyclotin)、錫蟎丹(cyhexatin)或芬布錫(fenbutatin oxide)，M.12C毆蟎多(propargite)或M.12D四氯殺蟎磺(tetradifon)；

M.13 經由破壞質子梯度之氧化磷酸化去偶合劑，例如克凡派(chlorfenapyr)、DNOC或氟蟲胺(sulfluramid)；

M.14 菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)通道阻斷劑，例如沙蠶毒素(nereistoxin)類似物殺蟲磺(bensultap)、培丹鹽酸鹽(cartap hydrochloride)、硫賜安(thiocyclam)或殺蟲雙(thiosultap sodium)；

M.15 甲殼素生物合成類型0之抑制劑，諸如苯甲醯基脲類，例如雙三氟蟲脲(bistrifluron)、克福隆(chlorfluazuron)、二福隆(diflubenzuron)、氟環脲(flucycloxuron)、氟芬隆(flufenoxuron)、六伏

隆(hexaflumuron)、祿芬隆(lufenuron)、諾伐隆(novaluron)、多氟脲(noviflumuron)、得福隆(teflubenzuron)或三福隆(triflumuron)；

M.16 甲殼素生物合成類型1之抑制劑，例如布芬淨(buprofezin)；

M.17 雙翅目昆蟲蛻皮干擾劑，例如賽滅淨(cyromazine)；

M.18 蛻皮素受體促效劑，諸如雙醯肼，例如滅芬諾(methoxyfenozide)、得芬諾(tebufenozide)、合芬隆(halofenozide)、呋喃蟲醯肼(fufenozide)或環蟲醯肼(chromafenozide)；

M.19 章魚胺受體促效劑，例如三亞蟎(amitraz)；

M.20 粒線體複合物III電子傳遞抑制劑，例如M.20A 愛美松(hydramethylnon)，M.20B 亞醯蟎(acequinocyl)，M.20C 嘧蟎酯(fluacrypyrim)；或M.20D畢芬載(bifenazate)；

M.21 粒線體複合物I電子傳遞抑制劑，例如M.21A METI殺蟎劑及殺昆蟲劑，諸如芬殺蟎(fenazaquin)、芬普蟎(fenpyroximate)、嘧蟎醚(pyrimidifen)、比達本(pyridaben)、得芬瑞(tebufenpyrad)或脫芬瑞(tolfenpyrad)，或M.21B魚藤酮(rotenone)；

M.22 電壓依賴性鈉通道阻斷劑，例如M.22A因得克(indoxacarb)，M.22B 氰氟蟲胺(metaflumizone)，或M.22B.1：2-[2-(4-氰基苯基)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亞乙基]-N-[4-(二氟甲氧基)苯基]-肼甲醯胺或M.22B.2：N-(3-氯-2-甲基苯基)-2-[(4-氯苯基)[4-[甲基(甲基磺醯基)胺基]苯基]亞甲基]-肼甲醯胺；

M.23 乙醯CoA羧化酶之抑制劑，諸如特窗酸(Tetronic acid)及特特拉姆酸(Tetramic acid)衍生物，例如賜派芬(spirodiclofen)、螺甲蟎酯(spiromesifen)或螺蟲乙酯(spirotetramat)；M.23.1螺派酮(spiropidion)

M.24 粒線體複合物IV電子傳遞抑制劑，例如M.24A磷，諸如磷化鋁、磷化鈣、磷化氫或磷化鋅，或M.24B氰化物；

M.25 粒線體複合物II電子傳遞抑制劑，諸如 β -酮基腈衍生物，例如腈吡蟎酯(cyenopyrafen)或丁氟蟎酯(cyflumetofen)；

M.28 二醯胺類之利阿諾定(Ryanodine)受體調節劑，例如氟蟲雙醯胺(flubendiamide)、氯蟲苯甲醯胺(chlorantraniliprole)、氰蟲醯胺(cyantraniliprole)、氟氰蟲醯胺(tetraniliprole)，M.28.1：(R)-3-氯-N1-{2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基}-N2-(1-甲基-2-甲基磺醯基乙基)鄰苯二甲醯胺，M.28.2：(S)-3-氯-N1-{2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基}-N2-(1-甲基-2-甲基磺醯基乙基)鄰苯二甲醯胺，M.28.3：環溴蟲醯胺(cyclaniliprole)或M.28.4：甲基-2-[3,5-二溴-2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}胺基)苯甲醯基]-1,2-二甲胍甲酸酯；或M.28.5a) N-[4,6-二氯-2-[(二乙基- λ -4-亞硫基)胺甲醯基]-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(三氟甲基)吡啶-3-甲醯胺；M.28.5b) N-[4-氯-2-[(二乙基- λ -4-亞硫基)胺甲醯基]-6-甲基-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(三氟甲基)吡啶-3-甲醯胺；M.28.5c) N-[4-氯-2-[(二-2-丙基- λ -4-亞硫基)胺甲醯基]-6-甲基-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(三氟甲基)吡啶-3-甲醯胺；M.28.5d) N-[4,6-二氯-2-[(二-2-丙基- λ -4-亞硫基)胺甲醯基]-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(三氟甲基)吡啶-3-甲醯胺；M.28.5h) N-[4,6-二溴-2-[(二乙基- λ -4-亞硫基)胺甲醯基]-苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)-5-(三氟甲基)吡啶-3-甲醯胺；M.28.5i) N-[2-(5-胺基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡啶-5-甲醯胺；M.28.5j) 3-氯-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[2,4-二氯-6-[(1-氰基-1-甲基乙基)胺基]羰基]苯基]-1H-吡啶-5-

甲醯胺； M.28.5k) 3-溴-N-[2,4-二氯-6-(甲基胺甲醯基)苯基]-1-(3,5-二氯-2-吡啶基)-1H-吡啶-5-甲醯胺； M.28.5l) N-[4-氯-2-[[[(1,1-二甲基乙基)胺基]羰基]-6-甲基苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(氟甲氧基)-1H-吡啶-5-甲醯胺；或

M.28.6：氯氟氰蟲醯胺(cyhalodiamide)；或

M.29：弦音器調節劑-不確定的靶位點，例如氟啶蟲醯胺(flonicamid)；

M.UN. 作用模式未知或不明確之殺昆蟲活性化合物，例如雙丙環蟲酯(afidopyropen)、阿福拉納(afoxolaner)、印楝素(azadirachtin)、安米氟美(amidoflumet)、苯蟎特(benzoximate)、溴蟲氟苯雙醯胺(broflanilide)、溴蟎酯(bromopropylate)、蟎離丹(chinomethionat)、冰晶石(cryolite)、敵克美施(dicloromezotiaz)、開樂散(dicofol)、氟芬內林(flufenerim)、氟美特啞(flometoquin)、氟噠蟲磺(flusulfone)、福薩豐(fluhexafon)、氟吡菌醯胺(fluopyram)、弗拉拉納(fluralaner)、噁蟲酮(metoxadiazone)、增效醚(piperonyl butoxide)、吡氟丁醯胺(pyflubumide)、啶蟲丙醚(pyridalyl)、泰噁殺芬(tioxazafen)，

M.UN.3：11-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-12-羥基-1,4-二氧雜-9-氮雜二螺[4.2.4.2]-十四-11-烯-10-酮，

M.UN.4：3-(4'-氟-2,4-二甲基聯苯-3-基)-4-羥基-8-氧雜-1-氮雜螺[4.5]癸-3-烯-2-酮，

M.UN.5：1-[2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亞磺醯基]苯基]-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺，或基於強固芽胞桿菌(bacillus firmus)(Votivo, I-1582)之活性劑；

M.UN.6：氟吡嘧(flupyrimin)；

M.UN.8：三氟咪啶醯胺(fluzaindolizine)；M.UN.9.a)：4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-異噁唑-3-基]-2-甲基-N-(1-側氧基硫雜環丁烷-3-基)苯甲醯胺；M.UN.9.b)：氟唑醯胺(fluxametamide)；M.UN.10：5-[3-[2,6-二氯-4-(3,3-二氯烯丙氧基)苯氧基]丙氧基]-1H-吡唑；

M.UN.11.b) 3-(苯甲醯基甲胺基)-N-[2-溴-4-[1,2,2,3,3,3-六氟-1-(三氟甲基)丙基]-6-(三氟甲基)苯基]-2-氟-苯甲醯胺；M.UN.11.c) 3-(苯甲醯基甲胺基)-2-氟-N-[2-碘-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]-6-(三氟甲基)苯基]-苯甲醯胺；M.UN.11.d) N-[3-[[[2-碘-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]-6-(三氟甲基)苯基]胺基]羰基]苯基]-N-甲基-苯甲醯胺；M.UN.11.e) N-[3-[[[2-溴-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]-6-(三氟甲基)苯基]胺基]羰基]-2-氟-苯基]-4-氟-N-甲基-苯甲醯胺；M.UN.11.f) 4-氟-N-[2-氟-3-[[[2-碘-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]-6-(三氟甲基)苯基]胺基]羰基]苯基]-N-甲基-苯甲醯胺；M.UN.11.g) 3-氟-N-[2-氟-3-[[[2-碘-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]-6-(三氟甲基)苯基]胺基]羰基]苯基]-N-甲基-苯甲醯胺；M.UN.11.h) 2-氯-N-[3-[[[2-碘-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]-6-(三氟甲基)苯基]胺基]羰基]苯基]-3-吡啶甲醯胺；M.UN.11.i) 4-氰基-N-[2-氰基-5-[[2,6-二溴-4-[1,2,2,3,3,3-六氟-1-(三氟甲基)丙基]苯基]胺甲醯基]苯基]-2-甲基-苯甲醯胺；M.UN.11.j) 4-氰基-3-[(4-氰基-2-甲基-苯甲醯基)胺基]-N-[2,6-二氯-4-[1,2,2,3,3,3-六氟-1-(三氟甲基)丙基]苯基]-2-氟-苯甲醯胺；M.UN.11.k) N-[5-[[2-氯-6-氰基-4-[1,2,2,3,3,3-六氟-1-(三氟甲基)丙基]苯基]胺甲醯基]-2-氰基-苯基]-4-氰基-2-甲基-苯甲醯胺；M.UN.11.l) N-[5-[[2-溴-6-氯-4-[2,2,2-三氟-1-羥基-1-(三氟甲基)乙

基]苯基]胺甲醯基]-2-氰基-苯基]-4-氰基-2-甲基-苯甲醯胺；M.UN.11.m)
 N-[5-[[2-溴-6-氯-4-[1,2,2,3,3,3-六氟-1-(三氟甲基)丙基]苯基]胺甲醯基]-
 2-氰基-苯基]-4-氰基-2-甲基-苯甲醯胺；M.UN.11.n) 4-氰基-N-[2-氰基-5-
 [[2,6-二氯-4-[1,2,2,3,3,3-六氟-1-(三氟甲基)丙基]苯基]胺甲醯基]苯基]-2-
 甲基-苯甲醯胺；M.UN.11.o) 4-氰基-N-[2-氰基-5-[[2,6-二氯-4-[1,2,2,2-
 四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基]胺甲醯基]苯基]-2-甲基-苯甲醯胺；
 M.UN.11.p) N-[5-[[2-溴-6-氯-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基]胺
 甲醯基]-2-氰基-苯基]-4-氰基-2-甲基-苯甲醯胺；或

M.UN.12.a) 2-(1,3-二氧雜環己烷-2-基)-6-[2-(3-吡啶基)-5-噻唑基]-
 吡啶；M.UN.12.b) 2-[6-[2-(5-氟-3-吡啶基)-5-噻唑基]-2-吡啶基]-嘧啶；
 M.UN.12.c) 2-[6-[2-(3-吡啶基)-5-噻唑基]-2-吡啶基]-嘧啶；M.UN.12.d)
 N-甲基磺醯基-6-[2-(3-吡啶基)噻唑-5-基]吡啶-2-甲醯胺；M.UN.12.e) N-
 甲基磺醯基-6-[2-(3-吡啶基)噻唑-5-基]吡啶-2-甲醯胺；M.UN.12.f) N-乙
 基-N-[4-甲基-2-(3-吡啶基)噻唑-5-基]-3-甲硫基-丙醯胺；M.UN.12.g) N-
 甲基-N-[4-甲基-2-(3-吡啶基)噻唑-5-基]-3-甲硫基-丙醯胺；M.UN.12.h)
 N,2-二甲基-N-[4-甲基-2-(3-吡啶基)噻唑-5-基]-3-甲硫基-丙醯胺；
 M.UN.12.i) N-乙基-2-甲基-N-[4-甲基-2-(3-吡啶基)噻唑-5-基]-3-甲硫基-
 丙醯胺；M.UN.12.j) N-[4-氯-2-(3-吡啶基)噻唑-5-基]-N-乙基-2-甲基-3-
 甲硫基-丙醯胺；M.UN.12.k) N-[4-氯-2-(3-吡啶基)噻唑-5-基]-N,2-二甲
 基-3-甲硫基-丙醯胺；M.UN.12.l) N-[4-氯-2-(3-吡啶基)噻唑-5-基]-N-甲
 基-3-甲硫基-丙醯胺；M.UN.12.m) N-[4-氯-2-(3-吡啶基)噻唑-5-基]-N-乙
 基-3-甲硫基-丙醯胺；

M.UN.14a) 1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-1,2,3,5,6,7-六氫-5-甲氧基-7-甲

基-8-硝基-咪唑并[1,2-a]吡啶；或M.UN.14b) 1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-7-甲基-8-硝基-1,2,3,5,6,7-六氫咪唑并[1,2-a]吡啶-5-醇；

M.UN.16a) 1-異丙基-N,5-二甲基-N-嗒嗪-4-基-吡啶-4-甲醯胺；或M.UN.16b) 1-(1,2-二甲基丙基)-N-乙基-5-甲基-N-嗒嗪-4-基-吡啶-4-甲醯胺；M.UN.16c) N,5-二甲基-N-嗒嗪-4-基-1-(2,2,2-三氟-1-甲基-乙基)吡啶-4-甲醯胺；M.UN.16d) 1-[1-(1-氰基環丙基)乙基]-N-乙基-5-甲基-N-嗒嗪-4-基-吡啶-4-甲醯胺；M.UN.16e) N-乙基-1-(2-氟-1-甲基-丙基)-5-甲基-N-嗒嗪-4-基-吡啶-4-甲醯胺；M.UN.16f) 1-(1,2-二甲基丙基)-N,5-二甲基-N-嗒嗪-4-基-吡啶-4-甲醯胺；M.UN.16g) 1-[1-(1-氰基環丙基)乙基]-N,5-二甲基-N-嗒嗪-4-基-吡啶-4-甲醯胺；M.UN.16h) N-甲基-1-(2-氟-1-甲基-丙基)-5-甲基-N-嗒嗪-4-基-吡啶-4-甲醯胺；M.UN.16i) 1-(4,4-二氟環己基)-N-乙基-5-甲基-N-嗒嗪-4-基-吡啶-4-甲醯胺；或M.UN.16j) 1-(4,4-二氟環己基)-N,5-二甲基-N-嗒嗪-4-基-吡啶-4-甲醯胺，

M.UN.17a) N-(1-甲基乙基)-2-(3-吡啶基)-2H-吡啶-4-甲醯胺；M.UN.17b) N-環丙基-2-(3-吡啶基)-2H-吡啶-4-甲醯胺；M.UN.17c) N-環己基-2-(3-吡啶基)-2H-吡啶-4-甲醯胺；M.UN.17d) 2-(3-吡啶基)-N-(2,2,2-三氟乙基)-2H-吡啶-4-甲醯胺；M.UN.17e) 2-(3-吡啶基)-N-[(四氫-2-呋喃基)甲基]-2H-吡啶-5-甲醯胺；M.UN.17f) 2-[[2-(3-吡啶基)-2H-吡啶-5-基]羰基]胍甲酸甲酯；M.UN.17g) N-[(2,2-二氟環丙基)甲基]-2-(3-吡啶基)-2H-吡啶-5-甲醯胺；M.UN.17h) N-(2,2-二氟丙基)-2-(3-吡啶基)-2H-吡啶-5-甲醯胺；M.UN.17i) 2-(3-吡啶基)-N-(2-噁啶基甲基)-2H-吡啶-5-甲醯胺；M.UN.17j) N-[(5-甲基-2-吡嗪基)甲基]-2-(3-吡啶基)-2H-吡啶-5-甲醯胺，

M.UN.18a) N-[3-氯-1-(3-吡啶基)吡啶-4-基]-N-乙基-3-(3,3,3-三氟丙基硫基)丙醯胺； M.UN.18b) N-[3-氯-1-(3-吡啶基)吡啶-4-基]-N-乙基-3-(3,3,3-三氟丙基亞磺基)丙醯胺； M.UN.18c) N-[3-氯-1-(3-吡啶基)吡啶-4-基]-3-[(2,2-二氟環丙基)甲基硫基]-N-乙基-丙醯胺； M.UN.18d) N-[3-氯-1-(3-吡啶基)吡啶-4-基]-3-[(2,2-二氟環丙基)甲基亞磺基]-N-乙基-丙醯胺；

M.UN.19薩洛拉納(sarolaner)， M.UN.20洛替拉納(lotilaner)；

M.UN.21 N-[4-氯-3-[(苯基甲基)胺基]羰基]苯基]-1-甲基-3-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)-1H-吡啶-5-甲醯胺； M.UN.22a 2-(3-乙基磺基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶，或 M.UN.22b 2-[3-乙基磺基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶；

M.UN.23a 4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-異噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-乙基-3-側氧基異噁唑啉-4-基]-2-甲基-苯甲醯胺，或M.UN.23b 4-[5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-異噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-乙基-3-側氧基-異噁唑啉-4-基]-2-甲基-苯甲醯胺；

M.UN.24a) N-[4-氯-3-(環丙基胺甲醯基)苯基]-2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡啶-3-甲醯胺或M.UN.24b) N-[4-氯-3-[(1-氰基環丙基)胺甲醯基]苯基]-2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡啶-3-甲醯胺； M.UN.25 艾諾派瑞 (acynonapyr)； M.UN.26 苯吡莫安 (benzpyrimoxan)； M.UN.27 2-氯-N-(1-氰基環丙基)-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡啶-3-基]吡啶-4-基]苯甲醯胺。

【0058】 以上列出之M組的市售化合物可見於The Pesticide

Manual, 第17版, C. MacBean, British Crop Protection Council (2015)以及其他出版物。在線殺有害生物劑手冊定期更新，可經由<http://bcpcdata.com/pesticide-manual.html>訪問。

【0059】 另一個提供ISO通用名稱之殺有害生物劑在線資料庫為<http://www.alanwood.net/pesticides>。

【0060】 M.4環氧蟲啉由WO2010/069266及WO2011/069456已知。M.4A.1由CN 103814937；CN105367557、CN 105481839已知。M.4A.2戊吡蟲胍(guadipyr)由WO 2013/003977已知，且M.4A.3 (在中國核准為哌蟲啉(paichongding))由WO 2007/101369已知。M.22B.1描述於CN10171577中且M.22B.2描述於CN102126994中。螺派酮M.23.1由WO 2014/191271已知。M.28.1及M.28.2由WO2007/101540已知。M.28.3描述於WO2005/077934中。M.28.4描述於WO2007/043677中。M.28.5a)至M.28.5d)及M.28.5h)描述於WO 2007/006670、WO2013/024009及WO 2013/024010中，M.28.5i)描述於WO2011/085575中，M.28.5j)描述於WO2008/134969中，M.28.5k)描述於US2011/046186中且M.28.5l)描述於WO2012/034403中。M.28.6可見於WO2012/034472中。M.UN.3由WO2006/089633已知且M.UN.4由WO2008/067911已知。M.UN.5描述於WO2006/043635中，且基於強固芽胞桿菌之生物控制劑描述於WO2009/124707中。氟吡嘧描述於WO2012/029672中。M.UN.8由WO2013/055584已知。M.UN.9.a)描述於WO2013/050317中。M.UN.9.b)描述於WO2014/126208中。M.UN.10由WO2010/060379已知。溴蟲氟苯雙醯胺及M.UN.11.b)至M.UN.11.h)描述於WO2010/018714中，且M.UN.11i)至M.UN.11.p)描述於WO 2010/127926中。M.UN.12.a)至

M.UN.12.c) 由 WO2010/006713 已知，M.UN.12.d) 及 M.UN.12.e) 由 WO2012/000896 已知，且 M.UN.12.f) 至 M.UN.12.m) 由 WO 2010/129497 已知。M.UN.14a) 及 M.UN.14b) 由 WO2007/101369 已知。M.UN.16.a) 至 M.UN.16h) 分別描述於 WO2010/034737、WO2012/084670 及 WO2012/143317 中，且 M.UN.16i) 及 M.UN.16j) 描述於 WO2015/055497 中。M.UN.17a) 至 M.UN.17.j) 描述於 WO2015/038503 中。M.UN.18a) 至 M.UN.18d) 描述於 US2014/0213448 中。M.UN.19 描述於 WO2014/036056 中。M.UN.20 由 WO2014/090918 已知。M.UN.21 由 EP2910126 已知。M.UN.22a 及 M.UN.22b 由 WO2015/059039 及 WO2015/190316 已知。M.UN.23a 及 M.UN.23b 由 WO2013/050302 已知。M.UN.24a 及 M.UN.24b 由 WO2012/126766 已知。艾諾派瑞 M.UN.25 由 WO 2011/105506 已知。苯吡莫安 M.UN.26 由 WO2016/104516 已知。M.UN.27 由 WO2016174049 已知。

【0061】 以下可結合本發明化合物使用之殺真菌劑的清單意欲說明根據本發明之方法中的可能組合，但不對其加以限制：

A) 呼吸抑制劑

- Qo 位點之複合物 III 的抑制劑：亞托敏(azoxystrobin) (A.1.1)，甲香菌酯(coumethoxystrobin) (A.1.2)，丁香菌酯(coumoxystrobin) (A.1.3)，地莫菌胺(dimoxystrobin) (A.1.4)，烯肱菌酯(enestroburin) (A.1.5)，烯肱菌胺(fenaminstrobin) (A.1.6)，菌蟻酯(fenoxystrobin)/氟菌蟻酯(flufenoxystrobin) (A.1.7)，氟嘧菌酯(fluxastrobin) (A.1.8)，克收欣(kresoxim-methyl) (A.1.9)，曼德托冰(mandestrobin) (A.1.10)，苯氧菌胺(metominostrobin) (A.1.11)，肱醚菌胺(oryastrobin) (A.1.12)，啞

氧菌酯(picoxystrobin) (A.1.13)，百克敏(pyraclostrobin) (A.1.14)，啞胺
 菌酯(pyrametostrobin) (A.1.15)，啞菌酯(pyraoxystrobin) (A.1.16)，三
 氟敏(trifloxystrobin) (A.1.17)，2 (2-(3-(2,6-二氯苯基)-1-甲基-亞烯丙基
 胺氧基甲基)-苯基)-2 甲氧亞胺基-N 甲基-乙醯胺(A.1.18)，吡菌苯威
 (pyribencarb) (A.1.19)，三環吡菌威(triclopyricarb)/ 氯啞菌酯
 (chlorodincarb) (A.1.20)，凡殺同(famoxadone) (A.1.21)，咪啞菌酮
 (fenamidone) (A.1.21)，甲基-N-[2-[(1,4-二甲基-5 苯基-吡啞-3-基)氧基
 甲基]苯基]-N-甲氧基-胺基甲酸酯(A.1.22)，1-[3-氯-2 [[1 (4-氯苯基)-1H-
 吡啞-3-基]氧基甲基]苯基]-4-甲基-四啞-5-酮(A.1.23)，1-[3-溴-2-[[1-(4-
 氯苯基)吡啞-3-基]氧基甲基]苯基]-4-甲基-四啞-5-酮(A.1.24)，1-[2-[[1-
 (4-氯苯基)吡啞-3-基]氧基甲基]-3-甲基-苯基]-4-甲基-四啞-5-酮
 (A.1.25)，1-[2-[[1-(4-氯苯基)吡啞-3-基]氧基甲基]-3-氟-苯基]-4-甲基-四
 啞-5-酮(A.1.26)，1-[2-[[1-(2,4-二氯苯基)吡啞-3-基]氧基甲基]-3-氟-苯
 基]-4-甲基-四啞-5-酮(A.1.27)，1-[3-環丙基-2-[[2-甲基-4 (1 甲基吡啞-3-
 基)苯氧基]甲基]苯基]-4 甲基-四啞-5-酮(A.1.30)，1 [3 (二氟甲氧基)-2-
 [[2-甲基-4-(1 甲基吡啞-3 基)苯氧基]甲基]苯基]-4 甲基-四啞-5-酮
 (A.1.31)，1-甲基-4-[3-甲基-2 [[2 甲基-4-(1-甲基吡啞-3 基)苯氧基]甲基]
 苯基]四啞-5-酮(A.1.32)，(Z,2E)-5-[1-(2,4-二氯苯基)吡啞-3-基]-氧基-2-
 甲氧亞胺基-N,3-二甲基-戊-3-烯醯胺(A.1.34)，(Z,2E) 5 [1 (4-氯苯基)吡
 啞-3-基]氧基-2-甲氧亞胺基-N,3-二甲基-戊-3-烯醯胺(A.1.35)，嘧蟻胺
 (pyriminostrobin) (A.1.36)，吡氟菌酯(bifujunzhi) (A.1.37)，2-(鄰-
 ((2,5-二甲基苯基-氧基-亞甲基)苯基)-3-甲氧基-丙烯酸甲酯(A.1.38)；

- Qi位點之複合物III的抑制劑：賽座滅(cyazofamid) (A.2.1)，吲啞

磺菌胺(amisulbrom) (A.2.2)，[(6S,7R,8R) 2-甲基丙酸8 苯甲基-3-[(3-羥基-4-甲氧基-吡啶-2-羰基)胺基]-6-甲基-4,9-二側氧基-1,5-二側氧基壬-7-基]酯(A.2.3)，芬吡醯胺(fenpicoxamid) (A.2.4)；

- 複合物II之抑制劑：麥鏽靈(benodanil) (A.3.1)，苯丙烯氟菌唑(benzovindiflupyr) (A.3.2)，必殺吩(bixafen) (A.3.3)，白可列(boscalid) (A.3.4)，萎鏽靈(carboxin) (A.3.5)，甲呋醯胺(fenfuram) (A.3.6)，氟吡菌醯胺(fluopyram) (A.3.7)，福多寧(flutolanil) (A.3.8)，氟唑菌醯胺(fluxapyroxad) (A.3.9)，福拉比(furametpyr) (A.3.10)，艾索非他米(isofetamid) (A.3.11)，吡唑萘菌胺(isopyrazam) (A.3.12)，滅普寧(mepronil) (A.3.13)，嘉保信(oxycarboxin) (A.3.14)，噴福芬(penflufen) (A.3.15)，吡噻菌胺(penthiopyrad) (A.3.16)，吡二氟甲多芬(pydiflumetofen) (A.3.17)，吡瑞氟密得(pyraziflumid) (A.3.18)，氟唑環菌胺(sedaxane) (A.3.19)，克枯爛(tecloftalam) (A.3.20)，賽氟滅(thifluzamide) (A.3.21)，3 (二氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基茛滿-4-基)吡啶-4 甲醯胺(A.3.22)，3 (三氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基茛滿-4-基)吡啶-4 甲醯胺(A.3.23)，1,3-二甲基-N-(1,1,3-三甲基茛滿-4-基)吡啶-4-甲醯胺(A.3.24)，3-(三氟甲基)-1,5 二甲基-N-(1,1,3-三甲基茛滿-4-基)吡啶-4-甲醯胺(A.3.25)，1,3,5-三甲基-N-(1,1,3-三甲基茛滿-4-基)吡啶-4-甲醯胺(A.3.26)，3-(二氟甲基)-1,5 二甲基-N-(1,1,3-三甲基茛滿-4-基)吡啶-4-甲醯胺(A.3.27)，3-(二氟甲基)-N (7 氟-1,1,3-三甲基-茛滿-4-基)-1-甲基-吡啶-4-甲醯胺(A.3.28)，N-[(5-氯-2-異丙基-苯基)甲基]-N-環丙基-5-氟-1,3-二甲基-吡啶-4-甲醯胺(A.3.29)，(E)-2-[2-[(5-氰基-2-甲基-苯氧基)甲基]苯基]-3-甲氧基-丙-2 烯酸甲酯(A.3.30)，N-[(5-氯-2-異丙基-苯

基)甲基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5 氟-1-甲基-吡啶-4-甲醯胺(A.3.31)，2-(二氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-茛滿-4-基)吡啶-3-甲醯胺(A.3.32)，2-(二氟甲基)-N-[(3R)-1,1,3-三甲基茛滿-4-基]吡啶-3-甲醯胺(A.3.33)，2-(二氟甲基)-N-(3-乙基-1,1-二甲基-茛滿-4-基)吡啶-3-甲醯胺(A.3.34)，2-(二氟甲基)-N-[(3R)-3-乙基-1,1-二甲基-茛滿-4-基]吡啶-3-甲醯胺(A.3.35)，2-(二氟甲基)-N-(1,1-二甲基-3-丙基-茛滿-4-基)吡啶-3-甲醯胺(A.3.36)，2-(二氟甲基)-N-[(3R)-1,1-二甲基-3-丙基-茛滿-4-基]吡啶-3-甲醯胺(A.3.37)，2-(二氟甲基)-N-(3-異丁基-1,1-二甲基-茛滿-4-基)吡啶-3-甲醯胺(A.3.38)，2-(二氟甲基)-N-[(3R)-3-異丁基-1,1-二甲基-茛滿-4 基]吡啶-3-甲醯胺(A.3.39)；

- 其他呼吸抑制劑：二氟林(diflumetorim) (A.4.1)；硝苯基衍生物：百蟻克(binapacryl) (A.4.2)，大脫蟻(dinobuton) (A.4.3)，白粉克(dinocap) (A.4.4)，扶吉胺(fluzinam) (A.4.5)，敵蟻普(meptyldinocap) (A.4.6)，富米綜(ferimzone) (A.4.7)；有機金屬化合物：薯瘟錫鹽(fentin salts)，例如三苯醋錫(fentin-acetate) (A.4.8)、三苯氯錫(fentin chloride) (A.4.9) 或三苯羥錫(fentin hydroxide) (A.4.10)；辛啞啞菌胺(ametoctradin) (A.4.11)；矽硫芬(silthiofam) (A.4.12)；

B) 固醇生物合成抑制劑(SBI殺真菌劑)

- C14去甲基酶抑制劑：三唑類：氧環唑(azaconazole) (B.1.1)、比多農(bitertanol) (B.1.2)、糠菌唑(bromuconazole) (B.1.3)、環克座(cyproconazole) (B.1.4)、待克利(difenoconazole) (B.1.5)、達克利(diniconazole) (B.1.6)、高效達克利(diniconazole-M) (B.1.7)、依普座(epoxiconazole) (B.1.8)、芬克座(fenbuconazole) (B.1.9)、氟啞唑

(fluquinconazole) (B.1.10)、護矽得 (flusilazole) (B.1.11)、護汰芬 (flutriafol) (B.1.12)、菲克利 (hexaconazole) (B.1.13)、亞胺唑 (imibenconazole) (B.1.14)、種菌唑 (ipconazole) (B.1.15)、滅特座 (metconazole) (B.1.17)、邁克尼 (myclobutanil) (B.1.18)、噁咪唑 (oxpoconazole) (B.1.19)、多效唑 (paclobutrazole) (B.1.20)、平克座 (penconazole) (B.1.21)、普克利 (propiconazole) (B.1.22)、丙硫菌唑 (prothioconazole) (B.1.23)、矽氟唑 (simeconazole) (B.1.24)、得克利 (tebuconazole) (B.1.25)、四克利 (tetraconazole) (B.1.26)、三泰芬 (triadimefon) (B.1.27)、三泰隆 (triadimenol) (B.1.28)、滅菌唑 (triticonazole) (B.1.29)、烯效唑 (uniconazole) (B.1.30)、伊分三康唑 (ipfentrifluconazole) (B.1.37)、甲分三康唑 (mefentrifluconazole) (B.1.38)、2-(氯甲基)-2-甲基-5-(對甲苯基甲基)-1 (1,2,4-三唑-1-基甲基) 環戊醇 (B.1.43)；咪唑類：依滅列 (imazalil) (B.1.44)、披扶座 (pefurazoate) (B.1.45)、咪醯胺 (prochloraz) (B.1.46)、賽福座 (triflumizol) (B.1.47)；嘧啶類、吡啶類及哌嗪類：芬瑞莫 (fenarimol) (B.1.49)、比芬諾 (pyrifenox) (B.1.50)、賽福寧 (triforine) (B.1.51)、[3-(4-氯-2-氟-苯基)-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-4-基]-(3-吡啶基) 甲醇 (B.1.52)；

- δ14- 還原酶抑制劑：阿迪嗎啉 (aldimorph) (B.2.1)、嗎菌靈 (dodemorph) (B.2.2)、嗎菌靈乙酸鹽 (dodemorph-acetate) (B.2.3)、芬普福 (fenpropimorph) (B.2.4)、三得芬 (tridemorph) (B.2.5)、苯鏽啶 (fenpropidin) (B.2.6)、粉病靈 (piperalin) (B.2.7)、螺環菌胺 (spiroxamine) (B.2.8)；

- 3-酮基還原酶之抑制劑：環醯菌胺(fenhexamid) (B.3.1)；
- 其他固醇生物合成抑制劑：氯苯肟唑(chlorphenomizole) (B.4.1)；

C) 核酸合成抑制劑

- 苯基醯胺或醯基胺基酸殺真菌劑：苯霜靈(benalaxyl) (C.1.1)、甲霜靈苯霜靈(benalaxyl-M) (C.1.2)、精苯霜靈(kiralaxyl) (C.1.3)、甲霜靈(metalaxyl) (C.1.4)、高效甲霜靈(metalaxyl-M) (C.1.5)、呋醯胺(ofurace) (C.1.6)、歐殺斯(oxadixyl) (C.1.7)；
- 其他核酸合成抑制劑：殺紋寧(hymexazole) (C.2.1)、辛噻酮(octhilinone) (C.2.2)、歐索林酸(oxolinic acid) (C.2.3)、布瑞莫(bupirimate) (C.2.4)、5-氟胞嘧啶(C.2.5)、5-氟-2-(對甲苯基甲氧基)嘧啶-4 胺(C.2.6)、5-氟-2-(4-氟苯基甲氧基)嘧啶-4 胺(C.2.7)、5-氟-2 (4 氯苯基甲氧基)嘧啶-4 胺(C.2.8)；

D) 細胞分裂及細胞骨架抑制劑

- 微管蛋白抑制劑：免賴得(benomyl) (D.1.1)，貝芬替(carbendazim) (D.1.2)，麥穗靈(fuberidazole) (D1.3)，腐絕(thiabendazole) (D.1.4)，甲基托布津(thiophanate-methyl) (D.1.5)，3-氯-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基-5-苯基-噁嗪(D.1.6)，3-氯-6-甲基-5-苯基-4-(2,4,6-三氟苯基)噁嗪(D.1.7)，N 乙基-2-[(3-乙炔基-8-甲基-6-喹啉基)氧基]丁醯胺(D.1.8)，N-乙基-2-[(3-乙炔基-8 甲基-6 喹啉基)氧基]-2-甲基硫基-乙醯胺(D.1.9)，2-[(3-乙炔基-8-甲基-6-喹啉-基)氧基]-N (2-氟乙基)丁醯胺(D.1.10)，2-[(3-乙炔基-8-甲基-6-喹啉基)氧基]-N-(2-氟乙基)-2-甲氧基-乙醯胺(D.1.11)，2-[(3-乙炔基-8-甲基-6-喹啉基)氧基]-N-丙基-丁醯胺

(D.1.12) , 2-[(3-乙炔基-8-甲基-6-喹啉基)氧基]-2-甲氧基-N-丙基-乙醯胺
 (D.1.13) , 2-[(3-乙炔基-8-甲基-6-喹啉基)氧基]-2-甲基硫基-N-丙基-乙醯
 胺(D.1.14) , 2 [(3 乙炔基-8-甲基-6-喹啉基)氧基]-N-(2-氟乙基)-2-甲基硫
 基-乙醯胺(D.1.15) , 4-(2-溴-4-氟-苯基)-N-(2-氯-6-氟-苯基)-2,5-二甲基-
 吡啶-3 胺(D.1.16) ;

- 其他細胞分裂抑制劑：乙黴威(diethofencarb) (D.2.1)、噻唑菌胺
 (ethaboxam) (D.2.2)、賓克隆(pencycuron) (D.2.3)、氟吡菌胺
 (fluopicolide) (D.2.4)、座賽胺(zoxamide) (D.2.5)、滅芬農(metrafenone)
 (D.2.6)、吡芬酮(pyriofenone) (D.2.7) ;

E) 胺基酸及蛋白質合成抑制劑

- 甲硫胺酸合成抑制劑：嘧菌環胺(cyprodinil) (E.1.1)、嘧菌胺
 (mepanipyrim) (E.1.2)、嘧黴胺(pyrimethanil) (E.1.3) ;

- 蛋白質合成抑制劑：殺稻瘟菌素-S (blasticidin-S) (E.2.1)、春日
 黴素(kasugamycin) (E.2.2)、春日黴素鹽酸鹽水合物(E.2.3)、米多黴素
 (mildiomycin) (E.2.4)、鏈黴素(streptomycin) (E.2.5)、土黴素
 (oxytetracyclin) (E.2.6) ;

F) 信號轉導抑制劑

- MAP/組胺酸激酶抑制劑：氟菌安(fluoroimid) (F.1.1)、依普同
 (iprodone) (F.1.2)、撲滅寧(procymidone) (F.1.3)、免克寧(vinclozolin)
 (F.1.4)、護汰寧(fludioxonil) (F.1.5) ;

- G蛋白抑制劑：快諾芬(quinoxifen) (F.2.1) ;

G) 脂質及膜合成抑制劑

- 磷脂生物合成抑制劑：護粒松(edifenphos) (G.1.1)、丙基喜樂松

(iprobenfos) (G.1.2)、白粉松(pyrazophos) (G.1.3)、稻瘟靈(isoprothiolane) (G.1.4)；

- 脂質過氧化：氯硝胺(dicloran) (G.2.1)、五氯硝基苯(quintozene) (G.2.2)、四氯硝基苯(tecnazene) (G.2.3)、脫克松(tolclofos-methyl) (G.2.4)、聯苯(G.2.5)、地茂散(chloroneb) (G.2.6)、依得利(etridiazole) (G.2.7)；

- 磷脂生物合成及細胞壁沈積：達滅芬(dimethomorph) (G.3.1)、氟嗎啉(flumorph) (G.3.2)、雙炔醯菌胺(mandipropamid) (G.3.3)、丁吡嗎啉(pyrimorph) (G.3.4)、苯噻菌胺(benthiavalicarb) (G.3.5)、縝黴威(iprovalicarb) (G.3.6)、威利芬那雷特(valifenalate) (G.3.7)；

- 影響細胞膜滲透性及脂肪酸之化合物：霜黴威(propamocarb) (G.4.1)；

- 氧化固醇結合蛋白之抑制劑：奧賽普林(oxathiapiprolin) (G.5.1)，甲磺酸2-{3-[2-(1-{[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡啶-1-基]乙醯基}哌啶-4-基)-1,3-噻啶-4-基]-4,5-二氫-1,2 噁啶-5-基}苯酯(G.5.2)，甲磺酸2-{3-[2-(1-{[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡啶-1-基]乙醯基}哌啶-4-基) 1,3-噻啶-4-基]-4,5-二氫-1,2-噁啶-5 基}-3-氯苯酯(G.5.3)，4-[1-[2-[3-(二氟甲基)-5-甲基-吡啶-1-基]乙醯基]-4-哌啶基]-N-萘滿-1-基-吡啶-2-甲醯胺(G.5.4)，4-[1-[2-[3,5-雙(二氟甲基)吡啶-1-基]乙醯基]-4-哌啶基]-N-萘滿-1-基-吡啶-2-甲醯胺(G.5.5)，4-[1-[2-[3-(二氟甲基)-5-(三氟甲基)吡啶-1-基]乙醯基]-4-哌啶基]-N-萘滿-1-基-吡啶-2-甲醯胺(G.5.6)，4-[1-[2-[5-環丙基-3-(二氟甲基)吡啶-1-基]乙醯基]-4-哌啶基]-N-萘滿-1-基-吡啶-2-甲醯胺(G.5.7)，4-[1-[2-[5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基]乙醯基]-4-哌啶基]-N-萘滿-1-基-吡啶-

2-甲醯胺(G.5.8)，4-[1-[2-[5-(二氟甲基)-3-(三氟甲基)吡唑-1-基]乙醯基]-4-哌啶基]-N-萘滿-1-基-吡啶-2-甲醯胺(G.5.9)，4 [1 [2-[3,5-雙(三氟甲基)吡唑-1-基]乙醯基]-4-哌啶基]-N-萘滿-1-基-吡啶-2-甲醯胺(G.5.10)，(4-[1-[2-[5-環丙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基]乙醯基]-4-哌啶基]-N-萘滿-1-基-吡啶-2-甲醯胺(G.5.11)；

H) 具有多位點作用之抑制劑

- 無機活性物質：波爾多液(H.1.1)、銅(H.1.2)、乙酸銅(H.1.3)、氫氧化銅(H.1.4)、鹼性氫氧化銅(H.1.5)、鹼式硫酸銅(H.1.6)、硫(H.1.7)；

- 硫代及二硫代胺基甲酸鹽：福美鐵(ferbam) (H.2.1)、鋅錳乃浦(mancozeb) (H.2.2)、錳乃浦(maneb) (H.2.3)、威百畝(metam) (H.2.4)、免得爛(metiram) (H.2.5)、甲基鋅乃浦(propineb) (H.2.6)、得恩地(thiram) (H.2.7)、鋅乃浦(zineb) (H.2.8)、益穗(ziram) (H.2.9)；

- 有機氯化化合物：敵菌靈(anilazine) (H.3.1)、四氯異苯腈(chlorothalonil) (H.3.2)、四氯丹(captafol) (H.3.3)、蓋普丹(captan) (H.3.4)、福爾培(folpet) (H.3.5)、益發靈(dichlofluanid) (H.3.6)、二氯酚(dichlorophen) (H.3.7)、六氯苯(H.3.8)、五氯酚(H.3.9)及其鹽、苯酞(phthalide) (H.3.10)、甲基益發靈(tolyfluanid) (H.3.11)；

- 胍類及其他：胍(H.4.1)、多寧(dodine) (H.4.2)、多寧游離鹼(H.4.3)、雙胍鹽(guazatine) (H.4.4)、雙胍鹽乙酸鹽(H.4.5)、克熱淨(iminoctadine) (H.4.6)、克熱淨三乙酸鹽(H.4.7)、克熱淨參(烷苯磺酸鹽)(H.4.8)、腈硫醯(dithianon) (H.4.9)、2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二噻吡并[2,3-c:5,6-c']二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮(H.4.10)；

I) 細胞壁合成抑制劑

- 葡聚糖合成抑制劑：維利微素(validamycin) (I.1.1)、保粒黴素B (polyoxin B) (I.1.2)；

- 黑色素合成抑制劑：百快隆(pyroquilon) (I.2.1)、三賽唑(tricyclazole) (I.2.2)、加普胺(carpropamid) (I.2.3)、雙氯氰菌胺(dicyclomet) (I.2.4)、氰菌胺(fenoxanil) (I.2.5)；

J) 植物防護誘導劑

- 酸化苯并噻二唑-S-甲酯(acibenzolar-S-methyl) (J.1.1)、撲殺熱(probenazole) (J.1.2)、異噻菌胺(isotianil) (J.1.3)、汰敵寧(tiadinil) (J.1.4)、調環酸鈣(prohexadione-calcium) (J.1.5)；磷酸鹽：福賽得(fosetyl) (J.1.6)、乙磷鋁(fosetyl-aluminum) (J.1.7)、亞磷酸及其鹽(J.1.8)、磷酸鈣(J.1.11)、磷酸鉀(J.1.12)、碳酸氫鉀或碳酸氫鈉(J.1.9)、4環丙基-N-(2,4-二甲氧基苯基)噻二唑-5-甲醯胺(J.1.10)；

K) 作用模式未知

- 溴硝醇(bronopol) (K.1.1)，螞離丹(chinomethionat) (K.1.2)，環氟菌胺(cyflufenamid) (K.1.3)，克絕(cymoxanil) (K.1.4)，邁隆(dazomet) (K.1.5)，咪菌威(debacarb) (K.1.6)，二氯西莫(diclocymet) (K.1.7)，達滅淨(diclomezine) (K.1.8)，野燕枯(difenzoquat) (K.1.9)，野燕枯甲基硫酸鹽(K.1.10)，二苯胺(diphenylamin) (K.1.11)，種衣酯(fenitropan) (K.1.12)，胺苯吡菌酮(fenpyrazamine) (K.1.13)，氟醯菌胺(flumetover) (K.1.14)，氟硫滅(flusulfamide) (K.1.15)，氟替尼(flutianil) (K.1.16)，超敏蛋白(harpin) (K.1.17)，磺菌威(metha-sulfocarb) (K.1.18)，氯啞(nitrapyrin) (K.1.19)，異丙消(nitrothal-isopropyl) (K.1.20)，托普洛卡(tolprocarb) (K.1.21)，快得寧(oxin-copper)

(K.1.22)，丙氧喹啉(proquinazid) (K.1.23)，特普弗洛奎(tebufloquin) (K.1.24)，克枯爛(tecloftalam) (K.1.25)，咪唑嗪(triazoxide) (K.1.26)，N'-(4-(4-氯-3-三氟甲基-苯氧基)-2,5-二甲基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒(K.1.27)，N'-(4-(4-氟-3-三氟甲基-苯氧基)-2,5-二甲基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒(K.1.28)，N'-[4-[[3-[(4-氯苯基)甲基]-1,2,4-噁二唑-5-基]氧基]-2,5-二甲基-苯基]-N-乙基-N-甲基-甲脒(K.1.29)，N'-(5-溴-6-茛滿-2-基氧基-2-甲基-3-吡啶基)-N-乙基-N-甲基-甲脒(K.1.30)，N'-[5-溴-6-[1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒(K.1.31)，N'-[5-溴-6-(4-異丙基環己氧基)-2-甲基-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒(K.1.32)，N' [5-溴-2-甲基-6-(1-苯基乙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒(K.1.33)，N'-(2-甲基-5-三氟甲基-4-(3-三甲基矽烷基-丙氧基)-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒(K.1.34)，N'-(5-二氟甲基-2-甲基-4-(3-三甲基矽烷基-丙氧基)-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒(K.1.35)，2-(4-氯-苯基)-N-[4-(3,4-二甲氧基-苯基)-異噁唑-5-基]-2-丙-2-炔氧基-乙醯胺(K.1.36)，3-[5-(4-氯-苯基)-2,3-二甲基-異噁唑啉-3-基]-吡啶(啞菌噁唑(pyrisoxazole)) (K.1.37)，3-[5-(4-甲基苯基)-2,3-二甲基-異噁唑啉-3-基]-吡啶(K.1.38)，5-氯-1-(4,6-二甲氧基-嘓啉-2-基)-2-甲基-1H-苯并咪唑(K.1.39)，(Z)-3-胺基-2-氰基-3-苯基-丙-2-烯酸乙酯(K.1.40)，皮卡布西(picarbutrazox) (K.1.41)，N-[6-[[[(Z)-[(1-甲基四唑-5-基)-苯基-亞甲基]胺基]氧基甲基]-2-吡啶基]胺基甲酸戊酯(K.1.42)，N-[6-[[[(Z)-[(1-甲基四唑-5-基)-苯基-亞甲基]胺基]氧基甲基]-2-吡啶基]胺基甲酸丁-3-炔基酯(K.1.43)，2-[2-[(7,8-二氟-2-甲基-3-喹啉基)氧基]-6-氟-苯基]丙-2-醇(K.1.44)，2-[2-氟-6-[(8-氟-2-甲基-3-喹啉基)氧基]苯基]丙-2-醇(K.1.45)，喹氟美林

(quinofumelin) (K.1.47)，9-氟-2,2-二甲基-5-(3-喹啉基)-3H 1,4 苯并噁氮吡(K.1.49)，2-(6-苯甲基-2-吡啶基)喹啉(K.1.50)，2-[6-(3-氟-4 甲氧基-苯基)-5-甲基-2-吡啶基]喹啉(K.1.51)，二氯苯噻(dichlobentiazox) (K.1.52)，N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒(K.1.53)；

二哌美酮(dipymetitrone)、異氟塞蘭(isoflucypram)；氟英達派(fluindapyr)、英派氟先(inpyrfluxam)、派里芬胺(pyrifenamine)。

【0062】 由IUPAC命名法描述之殺真菌劑、其製備及其殺有害生物活性亦為已知的(參見Can. J. Plant Sci. 48(6), 587-94, 1968；EP-A 141 317；EP-A 152 031；EP-A 226 917；EP-A 243 970；EP-A 256 503；EP-A 428 941；EP-A 532 022；EP-A 1 028 125；EP-A 1 035 122；EP-A 1 201 648；EP-A 1 122 244，JP 2002316902；DE 19650197；DE 10021412；DE 102005009458；US 3,296,272；US 3,325,503；WO 98/46608；WO 99/14187；WO 99/24413；WO 99/27783；WO 00/29404；WO 00/46148；WO 00/65913；WO 01/54501；WO 01/56358；WO 02/22583；WO 02/40431；WO 03/10149；WO 03/11853；WO 03/14103；WO 03/16286；WO 03/53145；WO 03/61388；WO 03/66609；WO 03/74491；WO 04/49804；WO 04/83193；WO 05/120234；WO 05/123689；WO 05/123690；WO 05/63721；WO 05/87772；WO 05/87773；WO 06/15866；WO 06/87325；WO 06/87343；WO 07/82098；WO 07/90624，WO 10/139271，WO 11/028657，WO2012/168188，WO 2007/006670，WO 2011/77514；WO13/047749，WO 10/069882，WO 13/047441，WO

03/16303 , WO 09/90181 , WO 13/007767 , WO 13/010862 , WO 13/127704 , WO 13/024009 , WO 13/024010 及 WO 13/047441 , WO 13/162072 , WO 13/092224 , WO 11/135833) , CN 1907024 , CN 1456054 , CN 103387541 , CN 1309897 , WO 12/84812 , CN 1907024 , WO 09094442 , WO 14/60177 , WO 13/116251 , WO 08/013622 , WO 15/65922 , WO 94/01546 , EP 2865265 , WO 07/129454 , WO 12/165511 , WO 11/081174 , WO 13/47441)。

【0063】 若本發明化合物與一或多種殺真菌劑混合，則混合物亦適用於對抗或控制由植物病原性真菌引起之植物疾病。稻中植物病原性真菌之實例為

稻上之交鏈孢屬(*Alternaria species*)、平臍蠕孢屬(*Bipolaris*) (例如稻平臍蠕孢 (*Bipolaris oryzae*)) 及稻上之內臍蠕孢屬 (*Drechslera species*)、稻尾孢 (*Cercospora oryzae*)、宮部旋孢腔菌 (*Cochliobolus miyabeanus*)、新月彎孢菌 (*Curvularia lunata*)、稻帚枝黴 (*Sarocladium oryzae*)、截孢帚枝黴 (*S. attenuatum*)、稻葉黑粉菌 (*Entyloma oryzae*)、鐮刀菌屬 (*Fusarium spp*) 諸如半裸鐮刀菌 (*Fusarium semitectum*) (及/或串珠鐮刀菌 (*Fusarium moniliforme*))

藤倉赤黴 (*Gibberella fujikuroi*) (惡苗病)、革蘭氏染色複合體(各種病原體)及/或腐黴屬 (*Pythium spp.*)

長蠕孢屬 (*Helminthosporium. spp*) 例如稻長蠕孢、稻微結節菌 (*Microdochium oryzae*)、稻瘟病菌 (*Pyricularia grisea*) (同義：稻梨孢)、絲核菌屬 (*Rhizoctonia species*) 例如立枯絲核菌 (*Rhizoctonia solani*) (同義：水稻紋枯病 (*Pellicularia sasakii*))、笹木伏革菌 (*Corticium sasakii*) 及

稻曲病菌(*Ustilagoidea virens*)。

【0064】 在另一個實施例中，本發明係關於根據本發明之方法，其施用包含如上所述之式(I)化合物，尤其I-1-R及至少一種化合物II之混合物，該化合物II為聚乙醛，尤其粒狀聚乙醛。

【0065】 在另一個實施例中，本發明係關於根據本發明之方法，其施用包含如上所述之式(I)化合物，尤其I-R-1及至少一種選自甲噻誘胺、蔥醌、 β -胺基丁酸、昆布糖、聚葡萄糖胺糖、硫胺素及核黃素之群之化合物II的混合物。

【0066】 在另一個實施例中，本發明係關於根據本發明之方法，其施用包含如上所述之式(I)化合物，尤其I-R-1及至少一種選自羥烯腺嘌呤(亦稱為玉米素)、活動素(羥烯)腺嘌呤、芸苔素內酯、苦皮藤(*Celastrus angulatus*)之殺昆蟲提取物、苦參鹼、蛇床子素、四環素之群之化合物II的混合物。

【0067】 在一個實施例中，本發明之方法包含藉由秧苗盒施用來施用至少一種本發明之化合物I與至少一種如上文所定義之混合搭配物II的混合物。在一個實施例中，本發明係關於藉由秧苗盒施用來施用一種化合物I與作為組分II的一種如上文所定義之混合搭配物II之二元混合物的方法。

【0068】 此類二元混合物之較佳重量比為5000:1至1:5000，較佳1000:1至1:1000，更佳100:1至1:100，尤其較佳10:1至1:10。在此類二元混合物中，組分I及II可以等量使用，或者可使用過量的組分I或過量的組分II。

【0069】 在本發明之混合物中，成分可依序使用或彼此組合使用，

若適宜，亦僅在使用之前立即添加(槽式混合)。舉例而言，在用化合物I處理之前或之後，可用化合物II噴灑植物。

【0070】 在另一個實施例中，本發明係關於藉由秧苗盒施用來施用一種化合物I與一種混合搭配物II及視情況選用之其他殺有害生物劑之混合物的方法。

【0071】 在本發明之一個實施例中，本發明之混合物為式(I)化合物，較佳I-R-1與選自以下之群之化合物的混合物：免賴得、貝芬替、依普座、氟啶唑、護汰芬、護矽得、滅特座、咪醯胺、丙硫菌唑、得克利、滅菌唑、百克敏、三氟敏、白可列、達滅芬、吡噻菌胺、嗎菌靈、凡殺同、芬普福、丙氧啶啉、嘧黴胺、三得芬、錳乃浦、鋅錳乃浦、免得爛、得恩地、四氯異苯腈、腈硫醯、氟硫滅、滅芬農、氟啶菌醯胺、必殺吩、噴福芬、氟啶環菌胺、吡啶萘菌胺。尤其較佳為百克敏及氟啶菌醯胺。

【0072】 在本發明之一個實施例中，本發明之混合物為式(I)化合物，較佳I-R-1與選自以下之群之化合物的混合物：吡蟲啉、噻蟲胺、呋蟲胺、氟蟲苯甲醯胺、氟蟲醯胺、賜諾特、賜諾殺、乙蟲清、氟蟲腈、三氟苯嘧啶、氟啶蟲醯胺及氟氟蟲醯胺。

【0073】 在本發明之一個實施例中，本發明之混合物為式(I)化合物，較佳I-R-1與選自以下之群之化合物的混合物：撲殺熱、異噻菌胺、三賽唑、百快隆、稻瘟靈、托普洛卡、加普胺、二氯西莫、亞托敏、肱醯菌胺。

【0074】 在本發明之一個實施例中，本發明之混合物為式(I)化合物，較佳I-R-1與選自以下之群之化合物的混合物：福拉比、賽氟滅、矽氟啶、噴福芬、亞托敏、肱醯菌胺。

【0075】 根據本發明之方法中尤其較佳的混合物列於下表M中，其中化合物I、I-R-1如本說明書中所定義：

表M：

混合物	化合物I	化合物II	混合物	化合物I	化合物II
M-1	I	氟蟲腓	M-38	I	因滅汀
M-2	I	α -賽滅寧	M-39	I	乙蟲清
M-3	I	克凡派	M-40	I	依芬寧
M-4	I	氰氟蟲胺	M-41	I	賜諾特
M-5	I	阿巴汀	M-42	I	賜諾殺
M-6	I	派滅淨	M-43	I	福薩豐
M-7	I	噻蟲嗪	M-44	I	七氟菊酯
M-8	I	吡蟲啉	M-45	I	沫氟寧
M-9	I	呋蟲胺	M-46	I	苯吡莫安
M-10	I	噻蟲胺	M-47	I	氯氟氰蟲醯胺
M-11	I	畢芬寧	M-48	I	螺派酮
M-12	I	啶蟲脒	M-49	I	氟吡嘧
M-13	I	烯啶蟲胺	M-50	I	環溴蟲醯胺
M-14	I	賽滅寧	M-51	I	氟唑醯胺
M-15	I	賽洛寧	M-52	I	泰噁殺芬
M-16	I	λ -賽洛寧	M-53	I	三氟咪啶醯胺
M-17	I	氟啶蟲醯胺	M-54	I	吡啶喹啉
M-18	I	螺蟲乙酯	M-55	I	聚乙醛(尤其粒狀)
M-19	I	布芬淨	M-56	I	免賴得
M-20	I	氯蟲苯甲醯胺	M-57	I	依普座
M-21	I	氰蟲醯胺	M-58	I	氟啶啉
M-22	I	氟氰蟲醯胺	M-59	I	護汰芬
M-23	I	氟啶蟲胺腈	M-60	I	護矽得
M-24	I	因得克	M-61	I	滅特座
M-25	I	雙丙環蟲酯	M-62	I	咪醯胺
M-26	I	溴蟲氟苯雙醯胺	M-63	I	丙硫菌啉
M-27	I	派瑞樂	M-64	I	得克利
M-28	I	三氟苯嘧啶	M-65	I	滅菌啉
M-29	I	氟吡呋喃酮	M-66	I	百克敏
M-30	I	敵克美施	M-67	I	三氟敏
M-31	I	陶斯松	M-68	I	白可列
M-32	I	二氯松	M-69	I	達滅芬
M-33	I	三落松	M-70	I	吡噻菌胺
M-34	I	培丹	M-71	I	嗎菌靈
M-35	I	歐殺松	M-72	I	凡殺同
M-36	I	加保扶	M-73	I	芬普福
M-37	I	丁基加保扶	M-74	I	丙氧喹啉

混合物	化合物I	化合物II
M-75	I	嘧黴胺
M-76	I	三得芬
M-77	I	錳乃浦
M-78	I	免得爛
M-79	I	得恩地
M-80	I	四氯異苯腈
M-81	I	腈硫醌
M-82	I	氟硫滅
M-83	I	滅芬農
M-84	I	氟唑菌醯胺
M-85	I	必殺吩
M-86	I	噴福芬
M-87	I	氟唑環菌胺
M-88	I	吡唑萘菌胺
M-89	I	三賽唑
M-90	I	亞托敏
M-91	I	待克利
M-92	I	春日黴素
M-93	I	稻瘟靈
M-94	I	托普洛卡
M-95	I	加普胺
M-96	I	二氯西莫
M-97	I	福拉比
M-98	I	矽氟唑
M-99	I	撲殺熱
M-100	I	鋅錳乃浦
M-101	I	普克利
M-102	I	菲克利
M-103	I	得克利
M-104	I	貝芬替
M-105	I	福多寧
M-106	I	殺紋寧
M-107	I	異噻菌胺
M-108	I	肱醌菌胺
M-109	I	賓克隆
M-110	I	苯酞
M-111	I	百快隆
M-112	I	賽氟滅
M-113	I	托布津
M-114	I	甲基托布津
M-115	I	汰敵寧
M-116	I	維利微素
M-117	I	特普弗洛奎

混合物	化合物I	化合物II
M-118	I	苯丙烯氟菌唑
M-119	I	皮卡布西
M-120	I	吡瑞氟密得
M-121	I	二哌美酮
M-122	I	吡二氟甲多芬
M-123	I	喹氟美林
M-124	I	伊分三康唑
M-125	I	二氯苯噻
M-126	I	芬吡醯胺
M-127	I	異氟塞蘭
M-128	I	氟英達派
M-129	I	英派氟先
M-130	I	派里芬胺
M-131	I	甲分三康唑
M-132	I-R-1	氟蟲腈
M-133	I-R-1	α -賽滅寧
M-134	I-R-1	克凡派
M-135	I-R-1	氰氟蟲胺
M-136	I-R-1	阿巴汀
M-137	I-R-1	派滅淨
M-138	I-R-1	噻蟲嗉
M-139	I-R-1	吡蟲啉
M-140	I-R-1	呋蟲胺
M-141	I-R-1	噻蟲胺
M-142	I-R-1	畢芬寧
M-143	I-R-1	啶蟲脒
M-144	I-R-1	烯啶蟲胺
M-145	I-R-1	賽滅寧
M-146	I-R-1	賽洛寧
M-147	I-R-1	λ -賽洛寧
M-148	I-R-1	氟啶蟲醯胺
M-149	I-R-1	螺蟲乙酯
M-150	I-R-1	布芬淨
M-151	I-R-1	氯蟲苯甲醯胺
M-152	I-R-1	氰蟲醯胺
M-153	I-R-1	氟氰蟲醯胺
M-154	I-R-1	氟啶蟲胺腈
M-155	I-R-1	因得克
M-156	I-R-1	雙丙環蟲酯
M-157	I-R-1	溴蟲氟苯雙醯胺
M-158	I-R-1	派瑞樂
M-159	I-R-1	三氟苯嘧啶
M-160	I-R-1	氟吡呋喃酮

混合物	化合物I	化合物II
M-161	I-R-1	敵克美施
M-162	I-R-1	陶斯松
M-163	I-R-1	二氯松
M-164	I-R-1	三落松
M-165	I-R-1	培丹
M-166	I-R-1	歐殺松
M-167	I-R-1	加保扶
M-168	I-R-1	丁基加保扶
M-169	I-R-1	因滅汀
M-170	I-R-1	乙蟲清
M-171	I-R-1	依芬寧
M-172	I-R-1	賜諾特
M-173	I-R-1	賜諾殺
M-174	I-R-1	福薩豐
M-175	I-R-1	七氟菊酯
M-176	I-R-1	沫氟寧
M-177	I-R-1	苯吡莫安
M-178	I-R-1	氯氟氰蟲醯胺
M-179	I-R-1	螺派酮
M-180	I-R-1	氟吡嘧
M-181	I-R-1	環溴蟲醯胺
M-182	I-R-1	氟唑醯胺
M-183	I-R-1	泰噁殺芬
M-184	I-R-1	三氟咪啉醯胺
M-185	I-R-1	哌氟喹啉
M-186	I-R-1	聚乙醛(尤其粒狀)
M-187	I-R-1	免賴得
M-188	I-R-1	依普座
M-189	I-R-1	氟喹啉
M-190	I-R-1	護汰芬
M-191	I-R-1	護矽得
M-192	I-R-1	滅特座
M-193	I-R-1	咪醯胺
M-194	I-R-1	丙硫菌唑
M-195	I-R-1	得克利
M-196	I-R-1	滅菌唑
M-197	I-R-1	百克敏
M-198	I-R-1	三氟敏
M-199	I-R-1	白可列
M-200	I-R-1	達滅芬
M-201	I-R-1	吡噻菌胺
M-202	I-R-1	嗎菌靈
M-203	I-R-1	凡殺同

混合物	化合物I	化合物II
M-204	I-R-1	芬普福
M-205	I-R-1	丙氧喹啉
M-206	I-R-1	嘧黴胺
M-207	I-R-1	三得芬
M-208	I-R-1	錳乃浦
M-209	I-R-1	免得爛
M-210	I-R-1	得恩地
M-211	I-R-1	四氯異苯腈
M-212	I-R-1	腈硫醯
M-213	I-R-1	氟硫滅
M-214	I-R-1	滅芬農
M-215	I-R-1	氟唑菌醯胺
M-216	I-R-1	必殺吩
M-217	I-R-1	噴福芬
M-218	I-R-1	氟唑環菌胺
M-219	I-R-1	吡唑萘菌胺
M-220	I-R-1	三賽唑
M-221	I-R-1	亞托敏
M-222	I-R-1	待克利
M-223	I-R-1	春日黴素
M-224	I-R-1	稻瘟靈
M-225	I-R-1	托普洛卡
M-226	I-R-1	加普胺
M-227	I-R-1	二氯西莫
M-228	I-R-1	福拉比
M-229	I-R-1	矽氟唑
M-230	I-R-1	撲殺熱
M-231	I-R-1	鋅錳乃浦
M-232	I-R-1	普克利
M-233	I-R-1	菲克利
M-234	I-R-1	得克利
M-235	I-R-1	貝芬替
M-236	I-R-1	福多寧
M-237	I-R-1	殺紋寧
M-238	I-R-1	異噻菌胺
M-239	I-R-1	肱醯菌胺
M-240	I-R-1	賓克隆
M-241	I-R-1	苯酞
M-242	I-R-1	百快隆
M-243	I-R-1	賽氟滅
M-244	I-R-1	托布津
M-245	I-R-1	甲基托布津
M-246	I-R-1	汰敵寧

混合物	化合物I	化合物II
M-247	I-R-1	維利微素
M-248	I-R-1	特普弗洛奎
M-249	I-R-1	苯丙烯氟菌唑
M-250	I-R-1	皮卡布西
M-251	I-R-1	吡瑞氟密得
M-252	I-R-1	二哌美酮
M-253	I-R-1	吡二氟甲多芬
M-254	I-R-1	喹氟美林

混合物	化合物I	化合物II
M-255	I-R-1	伊分三康唑
M-256	I-R-1	二氯苯噻
M-257	I-R-1	芬吡醯胺
M-258	I-R-1	異氟塞蘭
M-259	I-R-1	氟英達派
M-260	I-R-1	英派氟先
M-261	I-R-1	派里芬胺
M-262	I-R-1	甲分三康唑

【0076】 本發明之混合物可與其他活性成分組合且混合以在農業中施用，例如與其他殺有害生物劑、殺昆蟲劑、殺線蟲劑、殺真菌劑、除草劑、安全劑、肥料(諸如硝酸銨、尿素、鉀肥及過磷酸鈣)、植物毒劑及植物生長調節因子。

【0077】 此等混合物亦由術語「本發明之混合物」或「根據本發明之混合物」所涵蓋。

【0078】 此等額外成分可依序使用或與本發明之混合物組合使用，若適宜，亦僅在使用之前立即添加(槽式混合)。舉例而言，在用其他活性成分處理之前或之後，可用本發明之混合物噴灑植物。

【0079】 混合搭配物可選自殺有害生物劑，尤其殺昆蟲劑、殺線蟲劑及殺蟎劑、殺真菌劑、除草劑、植物生長調節因子、肥料及其類似物。較佳混合搭配物為殺昆蟲劑、殺線蟲劑及殺真菌劑。

【0080】 在一個實施例中，本發明係關於三元混合物，其包含化合物I、化合物II及另一種化合物III，其與已存在於混合物中之化合物I或II不同。

【0081】 在一個子實施例中，本發明係關於一種以下混合物：

- (1) 式(I)化合物，較佳I-R-1，及
- (2) 選自以下之群之化合物：吡蟲啉、噻蟲胺、呋蟲胺、氟蟲苯甲醯胺、氟蟲醯胺、賜諾特、賜諾殺、乙蟲清、氟蟲腓、三氟苯嘧啶、氟啶

蟲醯胺及氟氰蟲醯胺，及

(3) 選自以下之群之化合物：撲殺熱、異噻菌胺、三賽唑、百快隆、稻瘟靈、托普洛卡、加普胺、二氯西莫、亞托敏、肟醚菌胺。

【0082】 在一個實施例中，本發明係關於4路混合物，其包含化合物I、化合物II及另外兩種化合物III，其與已存在於混合物中之化合物I或II不同。

【0083】 在一個子實施例中，本發明係關於一種以下混合物：

(1) 式(I)化合物，較佳I-R-1，及

(2) 選自以下之群之化合物：吡蟲啉、噻蟲胺、呋蟲胺、氯蟲苯甲醯胺、氟蟲醯胺、賜諾特、賜諾殺、乙蟲清、氟蟲腓、三氟苯嘧啶、氟啶蟲醯胺及氟氰蟲醯胺，及

(3) 選自以下之群之化合物：撲殺熱、異噻菌胺、三賽唑、百快隆、稻瘟靈、托普洛卡、加普胺、二氯西莫、亞托敏、肟醚菌胺，及

(4) 選自以下之群之化合物：福拉比、賽氟滅、矽氟唑、噴福芬、亞托敏、肟醚菌胺，限制條件為其與(3)中之化合物不同。

【0084】 在一個實施例中，本發明係關於5路混合物，其包含化合物I、化合物II及另外三種化合物III，其與已存在於混合物中之化合物I或II不同。

【0085】 本發明亦關於方法，其中式(I)化合物提供或應用於包含助劑及式(I)化合物或其混合物的農用化學組合物中。

【0086】 農用化學組合物包含殺有害生物有效量之本發明化合物或其混合物。術語「殺有害生物有效量」定義如下。

【0087】 本發明化合物或其混合物可轉化成習用類型之農用化學組

合物，例如溶液、乳液、懸浮液、粉劑(dusts)、粉劑(powders)、糊劑、顆粒劑、壓製劑、膠囊及其混合物。組合物類型之實例為懸浮液(例如SC、OD、FS)、可乳化濃縮物(例如EC)、乳液(例如EW、EO、ES、ME)、膠囊(例如CS、ZC)、糊劑、片劑、可濕潤粉劑(例如WP、SP、WS、DP、DS)、壓製劑(例如BR、TB、DT)、顆粒劑(例如WG、SG、GR、FG、GG、MG)、殺昆蟲製品(例如LN)以及用於處理植物繁殖材料諸如種子之凝膠調配物(例如GF)。此等及其他組合物類型定義於「Catalogue of pesticide formulation types and international coding system」，Technical Monograph第2期，第6版。2008年5月，CropLife International中。

【0088】 組合物係以已知方式製備，諸如由Mollet and Grubemann, Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001；或Knowles, New developments in crop protection product formulation, Agrow Reports DS243, T&F Informa, London, 2005所述。

【0089】 適合助劑之實例為溶劑、液體載劑、固體載劑或填料、界面活性劑、分散劑、乳化劑、濕潤劑、佐劑、增溶劑、滲透增強劑、保護性膠體、黏著劑、增稠劑、保濕劑、防護劑、引誘劑、餵食刺激劑、增容劑、殺細菌劑、防凍劑、消泡劑、著色劑、增黏劑及黏合劑。

【0090】 適合之溶劑及液體載劑為水及有機溶劑，諸如中沸點至高沸點之礦物油餾分，例如煤油、柴油；植物或動物來源之油；脂族、環狀及芳族烴，例如甲苯、石蠟、四氫萘、烷基化萘；醇，例如乙醇、丙醇、丁醇、苯甲醇、環己醇；二醇；DMSO；酮，例如環己酮；酯，例如乳酸酯、碳酸酯、脂肪酸酯、 γ -丁內酯；脂肪酸；膦酸酯；胺；醯胺，例如N-

甲基吡咯啉酮、脂肪酸二甲基醯胺；及其混合物。

【0091】 適合之固體載劑或填料為礦物土，例如矽酸鹽、矽膠、滑石、高嶺土、石灰石、石灰、白堊、黏土、白雲石、矽藻土、膨潤土、硫酸鈣、硫酸鎂、氧化鎂；多醣粉末，例如纖維素、澱粉；肥料，例如硫酸銨、磷酸銨、硝酸銨、尿素；植物來源之產品，例如穀物粉、樹皮粉、木粉、堅果殼粉及其混合物。

【0092】 適合之界面活性劑為表面活性化合物，諸如陰離子型、陽離子型、非離子型及兩性界面活性劑；嵌段聚合物、聚電解質及其混合物。此類界面活性劑可用作乳化劑、分散劑、增溶劑、濕潤劑、滲透增強劑、保護性膠體或佐劑。界面活性劑之實例列於McCutcheon之第1卷: *Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008* (國際版或北美版)中。

【0093】 適合之陰離子型界面活性劑為磺酸鹽、硫酸鹽、磷酸鹽、羧酸鹽之鹼金屬、鹼土金屬或銨鹽及其混合物。磺酸鹽之實例為烷芳基磺酸鹽、二苯基磺酸鹽、 α -烯烴磺酸鹽、木質素磺酸鹽、脂肪酸及油之磺酸鹽、乙氧基化烷基酚之磺酸鹽、烷氧基化芳基酚之磺酸鹽、縮合萘之磺酸鹽、十二烷基及十三烷基苯之磺酸鹽、萘及烷基萘之磺酸鹽、磺基琥珀酸鹽或磺基琥珀醯胺酸鹽。硫酸鹽之實例為脂肪酸及油、乙氧基化烷基酚、醇、乙氧基化醇或脂肪酸酯之硫酸鹽。磷酸酯之實例為磷酸酯。羧酸鹽之實例為烷基羧酸鹽及羧化醇或烷基苯酚乙氧基化物。

【0094】 適合之非離子型界面活性劑為烷氧基化物、N-取代之脂肪酸醯胺、胺氧化物、酯、糖基界面活性劑、聚合物界面活性劑及其混合物。烷氧基化物之實例為已用1至50當量烷氧基化之化合物，諸如醇、烷

基酚、胺、醯胺、芳基酚、脂肪酸或脂肪酸酯。可採用環氧乙烷及/或環氧丙烷，較佳環氧乙烷進行烷氧基化。N-取代之脂肪酸醯胺的實例為脂肪酸葡萄糖醯胺或脂肪酸烷醇醯胺。酯之實例為脂肪酸酯、甘油酯或單酸甘油酯。糖基界面活性劑之實例為脫水山梨糖醇、乙氧基化脫水山梨糖醇、蔗糖及葡萄糖酯或烷基聚葡萄糖苷。聚合物界面活性劑之實例為乙烷基吡咯啉酮、乙烯醇或乙酸乙烯酯之均聚物或共聚物。

【0095】 適合之陽離子型界面活性劑為四級界面活性劑，例如具有一或兩個疏水性基團之四級銨化合物，或長鏈一級胺之鹽。適合之兩性界面活性劑為烷基甜菜鹼及咪唑啉。適合之嵌段聚合物為包含聚環氧乙烷及聚環氧丙烷嵌段之A-B或A-B-A型嵌段聚合物，或包含烷醇、聚環氧乙烷及聚環氧丙烷之A-B-C型嵌段聚合物。適合之聚電解質為多元酸或多元鹼。多元酸之實例為聚丙烯酸之鹼金屬鹽或多元酸梳狀聚合物。多元鹼之實例為聚乙烯胺或聚伸乙胺。

【0096】 適合之佐劑為本身具有可忽略的殺有害生物活性或甚至無殺有害生物活性，且改良本發明化合物對目標之生物效能的化合物。實例為界面活性劑、礦物油或植物油及其他助劑。其他實例由 Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, 第5章列舉。

【0097】 適合之增稠劑為多糖(例如三仙膠、羧甲基纖維素)、非有機黏土(經有機改質或未經改質)、聚羧酸鹽及矽酸鹽。

【0098】 適合之殺細菌劑為溴硝醇及異噻唑啉酮衍生物，諸如烷基異噻唑啉酮及苯并異噻唑啉酮。

【0099】 適合之防凍劑為乙二醇、丙二醇、尿素及甘油。

【0100】 適合之消泡劑為聚矽氧、長鏈醇及脂肪酸鹽。

【0101】 適合之著色劑(例如呈紅色、藍色或綠色)為低水溶性顏料及水溶性染料。實例為無機著色劑(例如氧化鐵、氧化鈦、六氰亞鐵酸鐵)及有機著色劑(例如茜素菁、偶氮菁及酞菁著色劑)。

【0102】 適合之增黏劑或黏合劑為聚乙烯吡咯啉酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇、聚丙烯酸酯、生物或合成蠟及纖維素醚。

【0103】 組合物類型及其製備之實例為：

i) 水溶性濃縮物(SL、LS)

將10-60重量%根據本發明之化合物I及5-15重量%濕潤劑(例如醇烷氧基化物)溶解於水及/或水溶性溶劑(例如醇)中直至100重量%。活性物質在用水稀釋時溶解。

ii) 可分散濃縮物(DC)

將5-25重量%根據本發明之化合物I及1-10重量%分散劑(例如聚乙烯吡咯啉酮)溶解於至多100重量%有機溶劑(例如環己酮)中。用水稀釋得到分散液。

iii) 可乳化濃縮物(EC)

將15-70重量%根據本發明之化合物I及5-10重量%乳化劑(例如十二烷基苯磺酸鈣及蓖麻油乙氧基化物)溶解於至多100重量%水不溶性有機溶劑(例如芳族烴)中。用水稀釋得到乳液。

iv) 乳液(EW、EO、ES)

將5-40重量%根據本發明之化合物I及1-10重量%乳化劑(例如十二烷基苯磺酸鈣及蓖麻油乙氧基化物)溶解於20-40重量%水不溶性有機溶劑(例如芳族烴)中。藉助於乳化機將此混合物引入至多100重量%水中且製成均

質乳液。用水稀釋得到乳液。

v) 懸浮液(SC、OD、FS)

在攪動式球磨機中，將20-60重量%根據本發明之化合物I粉碎，添加2-10重量%分散劑及濕潤劑(例如木質素磺酸鈉及醇乙氧基化物)、0.1-2重量%增稠劑(例如三仙膠)及至多100重量%水，得到細活性物質懸浮液。用水稀釋得到活性物質之穩定懸浮液。對於FS型組合物，添加高達40重量%黏合劑(例如聚乙烯醇)。

vi) 水分散性顆粒劑及水溶性顆粒劑(WG、SG)

將50-80重量%根據本發明之化合物I細磨，添加至多100重量%分散劑及濕潤劑(例如木質素磺酸鈉及醇乙氧基化物)且藉助於工業級設備(例如擠出、噴霧塔、流化床)製備為水分散性或水溶性顆粒劑。用水稀釋得到活性物質之穩定分散液或溶液。

vii) 水分散性粉劑及水溶性粉劑(WP、SP、WS)

將50-80重量%根據本發明之化合物I在轉子-定子磨機中研磨，添加1-5重量%分散劑(例如木質素磺酸鈉)、1-3重量%濕潤劑(例如醇乙氧基化物)及至多100重量%固體載劑，例如矽膠。用水稀釋得到活性物質之穩定分散液或溶液。

viii) 凝膠(GW、GF)

在攪動式球磨機中，將5-25重量%根據本發明之化合物I粉碎，添加3-10重量%分散劑(例如木質素磺酸鈉)、1-5重量%增稠劑(例如羧甲基纖維素)及至多100重量%水，得到活性物質之細懸浮液。用水稀釋得到活性物質之穩定懸浮液。

ix) 微乳液(ME)或奈米乳液

將5-20重量%根據本發明之化合物I添加至5-30重量%有機溶劑摻合物(例如脂肪酸二甲醯胺及環己酮)、10-25重量%界面活性劑摻合物(例如醇乙氧基化物及芳基酚乙氧基化物)及補足至100%之水中。攪拌此混合物1小時以自發地產生熱力學上穩定之微乳液。

x) 微膠囊(CS)

將包含5-50重量%根據本發明之化合物I的油相、0-40重量%水不溶性有機溶劑(例如芳族烴)、2-15重量%丙烯酸單體(例如甲基丙烯酸甲酯、甲基丙烯酸及二丙烯酸酯或三丙烯酸酯)分散於保護性膠體(例如聚乙烯醇)之水溶液中。由自由基引發劑引發之自由基聚合使得聚(甲基)丙烯酸酯微膠囊形成。或者，將包含5-50重量%根據本發明之化合物I的油相、0-40重量%水不溶性有機溶劑(例如芳族烴)及異氰酸酯單體(例如二苯基亞甲基-4,4'-二異氰酸酯)分散於保護性膠體(例如聚乙烯醇)之水溶液。添加多元胺(例如己二胺)使得形成聚脲微膠囊。單體共計1-10重量%。wt%係關於整個CS組合物。

xi) 可撒佈粉劑(DP、DS)

將1-10重量%根據本發明之化合物I細磨且與至多100重量%固體載劑(例如細粉狀高嶺土)緊密混合。

xii) 顆粒劑(GR、FG)

將0.5-30重量%根據本發明之化合物I細磨且與至多100重量%固體載劑(例如矽酸鹽)相關聯。藉由擠出、噴霧乾燥或流化床實現造粒。

xiii) 超低容量液體(UL)

將1-50重量%根據本發明之化合物I溶解於至多100重量%有機溶劑(例如芳族烴)中。

【0104】 組合物類型i)至xiii)可視情況包含其他助劑，諸如0.1-1重量%殺細菌劑、5-15重量%防凍劑、0.1-1重量%消泡劑及0.1-1重量%著色劑。

【0105】 農用化學組合物一般包含0.01至95重量%、較佳0.1至90重量%且最佳0.5至75重量%之活性物質。所用活性物質之純度為90%至100%、較佳95%至100% (根據NMR譜)。

【0106】 可將各種類型之油、濕潤劑、佐劑、肥料或微量營養素及其他殺有害生物劑(例如除草劑、殺昆蟲劑、殺真菌劑、生長調節因子、安全劑)添加至活性物質或包含活性物質之組合物中作為預混物，或若適宜直至使用之前立即添加(槽式混合)。此等試劑可以1:100至100:1、較佳1:10至10:1之重量比與根據本發明之組合物混合。

【0107】 在一個實施例中，懸浮濃縮物(SC)對於作物保護中之施用為較佳的。在其一個子實施例中，SC農用化學組合物包含50至500 g/L(公克每公升)，或100至250 g/L，或100 g/L或150 g/L或200 g/L或250 g/L。

【0108】 在另一個實施例中，根據調配物類型xii之顆粒劑根據本發明用於稻中的施用。

【0109】 在另一個實施例中，根據調配物類型ii之可分散濃縮物DC根據本發明用於稻中的施用。

【0110】 在另一個實施例中，根據調配物類型iii之可乳化濃縮物EC根據本發明用於稻中之施用。

【0111】 在另一個實施例中，根據調配物類型ix之微乳液ME根據本發明用於稻中之施用。

【0112】 在另一個實施例中，奈米乳液根據本發明用於稻中之施

用。

【0113】 使用者通常自前給藥式裝置、背負式噴霧器、噴霧槽、噴霧飛機或灌溉系統施用根據本發明之組合物。通常，農用化學組合物用水、緩衝劑及/或其他助劑配製成所需施用濃度，且由此獲得即用型噴霧液或根據本發明之農用化學組合物。通常，每公頃農業有用區域施用20至2000公升、較佳50至400公升即用型噴霧液。

【0114】 根據一個實施例，根據本發明之組合物的個別組分，諸如套組之部分或二元或三元混合物之部分，可由使用者自己在噴霧槽中混合，且若適宜可添加其他助劑。

【0115】 在另一個實施例中，根據本發明之組合物的個別組分或部分預混合的組分，例如包含本發明化合物及/或如上文所定義之混合搭配物的組分，可由使用者在噴霧槽中混合，且若適宜可添加其他助劑及添加劑。

【0116】 在另一個實施例中，根據本發明之組合物的個別組分或部分預混合的組分，例如包含本發明化合物及/或如上文所定義之混合搭配物的組分，可共同(例如在槽式混合之後)或連續施用。

【0117】 本發明亦關於方法，其中式(I)化合物適用於保護稻、稻植物、稻植物繁殖材料(諸如種子)或稻植物生長的土壤或水免受稻有害生物，尤其稻有害無脊椎動物侵襲或侵染。因此，本發明亦關於植物保護方法，其包含使欲保護免受稻有害生物，尤其稻有害無脊椎動物侵襲或侵染之稻、稻植物、稻植物繁殖材料(諸如種子)或植物生長之土壤或水與殺有害生物有效量之本發明化合物接觸。

【0118】 本發明亦關於對抗或控制稻有害生物，尤其稻有害無脊椎

動物之方法，其包含使稻有害生物，尤其稻有害無脊椎動物，其棲息地、繁殖地或食物供應地，或稻、稻植物、稻植物繁殖材料(諸如種子)，或土壤或水，或稻有害生物，尤其稻有害無脊椎動物正生長或可生長之區域、材料或環境與殺有害生物有效量之本發明化合物接觸。

【0119】 本發明化合物經由接觸及攝入均為有效的。此外，本發明化合物可施用於任何及所有發育階段，諸如卵、幼蟲、蛹及成蟲。

【0120】 本發明化合物可原樣施用或以如上文所定義之包含其之組合物形式施用。此外，本發明化合物可與如上文所定義之混合搭配物一起施用或以如上文所定義之包含該等混合物之組合物形式施用。該混合物之組分可同時、共同或分開、或依次(亦即一個緊接著另一個)施用，從而在所需位置(例如植物)「原位」產生混合物，在分開施用之情況下，順序一般對控制措施之結果無任何影響。

【0121】 施用可在有害生物侵染稻、稻植物、稻植物繁殖材料(諸如種子)、土壤、或區域、材料或環境之前及之後進行。

【0122】 適合之施用方法尤其包括土壤處理、種子處理、犁溝施用、進水口施用及葉面施用。土壤處理方法包括浸透土壤、浸根或土壤注入。種子處理技術包括拌種、種子包衣、種子撒粉、種子浸泡及種子丸化。犁溝施用通常包括在耕地上形成犁溝，用種子播種犁溝，將殺有害生物活性化合物施用於犁溝及封閉犁溝的步驟。葉面施用係指將殺有害生物活性化合物施用於植物葉子，例如經由噴霧設備。對於葉面施用，藉由使用信息素與本發明化合物的組合來改變有害生物的行為可為有利的。用於特定作物及有害生物之適合的信息素為技術人員已知的，且可自信息素及化學信息素之資料庫公開獲得，諸如<http://www.pherobase.com>。

【0123】 在稻栽培及稻作物之情形下，以下施用類型具有特殊相關性：

- 「粒狀施用」 涉及將殺昆蟲劑顆粒或殺昆蟲劑/殺真菌劑及殺線蟲劑之混合物直接人工或機械散佈或投入田地或土壤表面或積水上之育苗盒中。粒狀調配物可與填料、載劑或肥料混合，以允許在田地中均勻分佈。

- 「漂浮包施用」 係指水溶性小袋/包中之殺昆蟲劑或殺昆蟲劑/殺真菌劑及殺線蟲劑之混合物藉由投入積水中之稻田中的施用。

- 「秧苗盒施用」 係指在移栽於主要田地之前，在育苗盒或含有稻秧苗之秧苗盒中人工或機械併入殺昆蟲劑調配物(例如顆粒劑、液體)。

- 「種子處理」 涉及將稻種子浸泡/混合在殺昆蟲劑或殺昆蟲劑/殺線蟲劑/殺真菌劑混合物之溶液中。此施用在播種之前、在種子萌發之前或之後進行。

- 「葉面施用」 係指使用各種施用設備(例如背負式、動力噴霧器、噴桿式噴霧器等)將水或油中之殺昆蟲劑或殺昆蟲劑/殺真菌劑/殺線蟲劑/選擇性除草劑以噴霧施用形式施用。

- 「土壤施用」 係指將殺昆蟲劑或殺昆蟲劑/殺真菌劑/殺線蟲劑/選擇性除草劑之混合物以澆灌施用、進水口施用或粒狀施用形式施加於土壤中。

- 「空中施用」 係指使用飛機、直升機或無人機將殺昆蟲劑或殺昆蟲劑/殺真菌劑/殺線蟲劑/選擇性除草劑之混合物粒狀或液體施用於田地的施用。

- 「粉劑施用」 涉及使用專門施用器(例如動力撒粉器)將殺昆蟲劑或殺昆蟲劑/殺真菌劑/殺線蟲劑/選擇性除草劑之混合物以粉劑調配物形式直

接施用於田地的直接施用。

- 「進水口施用」為將殺昆蟲劑或殺昆蟲劑/殺真菌劑/殺線蟲劑/選擇性除草劑之混合物的液體調配物施用於將灌溉水釋放於稻田中的地點。

- 「環繞施用」為將殺昆蟲劑或殺昆蟲劑/殺真菌劑/殺線蟲劑/選擇性除草劑之混合物的液體或粒狀調配物以順時針或逆時針方向施用於稻田邊界內的積水中的施用類型。

【0124】 較佳施用為粒狀施用、秧苗盒施用及葉面施用。

【0125】 在一個實施例中，本發明係關於藉由粒狀施用來施用殺有害生物劑的方法。

【0126】 在一個實施例中，本發明係關於藉由秧苗盒施用來施用殺有害生物劑的方法。

【0127】 在一個實施例中，本發明係關於藉由葉面施用來施用殺有害生物劑的方法。

【0128】 如本文所用，術語「接觸」或「施用」包括直接接觸(將化合物/組合物直接施用於動物有害生物或植物 - 通常施用於植物的葉、莖或根)及間接接觸(將化合物/組合物施用於動物有害生物或植物的所在地，亦即棲息地、繁殖地、植物、種子、土壤、有害生物正生長或可生長的區域、材料或環境)。

【0129】 在本發明之上下文中，術語「動物有害生物」包括節肢動物、腹足動物及線蟲，其為稻有害生物，尤其稻有害無脊椎動物，尤其如上所述之稻有害昆蟲。節肢動物較佳為昆蟲及蛛形綱動物，尤其昆蟲。特別相關之昆蟲通常稱為作物昆蟲有害生物或稻有害昆蟲。

【0130】 術語「作物」係指生長及收穫的稻。

【0131】 在本發明之上下文中，術語「植物」較佳意謂稻植物(稻屬物種，較佳稻)。最常種植兩種稻，稻及光稈稻(*Oryza glaberrima*)。稻之許多亞種為商業上重要的，包括秈稻(*Oryza sativa* subsp. *indica*)、粳稻(*Oryza sativa* subsp. *japonica*)、爪哇稻(*Oryza sativa* subsp. *javanica*)、糯稻(*Oryza sativa* subsp. *glutinosa*) (glutinous rice)、香稻(*Oryza sativa* Aromatica group) (例如巴斯馬蒂香米(basmati))及稻(浮稻)。術語「植物」應理解為包括野生型植物及已藉由習知育種，或突變誘發或基因工程改造，或藉由其組合修飾的植物。

【0132】 已藉由突變誘發或基因工程改造修飾且具有特別商業重要性之植物包括稻。在已藉由突變誘發或基因工程改造修飾之植物中，一或多個基因已經誘變或整合至植物之遺傳物質中。一或多個經誘變或整合之基因較佳選自 *pat*、*epsps*、*cry1Ab*、*bar*、*cry1Fa2*、*cry1Ac*、*cry34Ab1*、*cry35AB1*、*cry3A*、*cryF*、*cry1F*、*mcry3a*、*cry2Ab2*、*cry3Bb1*、*cry1A.105*、*dfr*、*barnase*、*vip3Aa20*、*barstar*、*als*、*bxn*、*bp40*、*asn1* 及 *ppo5*。進行一或多個基因之突變誘發或整合以改良植物之某些特性。此類特性，亦稱為性狀，包括非生物脅迫耐受性、改變之生長/產量、抗病性、除草劑耐受性、昆蟲抗性、改良之產品品質及授粉控制。在此等特性中，除草劑耐受性，例如咪唑啉酮耐受性、草甘膦耐受性或固殺草耐受性為特別重要的。

【0133】 已出乎意料地發現，本發明化合物之殺有害生物活性可藉由經修飾之植物的殺昆蟲性狀來增強。此外，已發現本發明化合物適用於防止昆蟲對殺昆蟲性狀產生抗性或對抗已對經修飾之植物的殺昆蟲性狀具有抗性的有害生物。此外，本發明化合物適用於對抗殺昆蟲性狀對其無效

之有害生物，因此可有利地使用補充的殺昆蟲活性。

【0134】 術語「植物繁殖材料」係指植物之所有生殖部分，諸如種子、發芽種子、幼苗及再生株。亦可包括在萌發後或自土壤出苗後移植的幼苗及幼小植物。此等植物繁殖材料可在種植或移植時或之前用植物保護化合物預防性處理。

【0135】 術語「種子」涵蓋所有類別之種子及植物繁殖體，包括但不限於真正的種子、種子塊、吸根、球莖、果實、穀粒、插條、切枝及其類似物，且在一個較佳實施例中意謂真正的種子。

【0136】 一般而言，「殺有害生物有效量」意謂實現對生長可觀察到的效應，包括壞死、死亡、阻滯、預防及移除、破壞或以其他方式減少目標生物體出現及活動的效應所需的活性成分之量。對於本發明中所用之各種化合物/組合物，殺有害生物有效量可變化。殺有害生物有效量之組合物亦將根據主要條件而變化，諸如所需殺有害生物效應及持續時間、天氣、目標物種、所在地、施用模式及其類似物。

【0137】 在土壤處理、犁溝施用或施用於有害生物棲息地或巢穴之情況下，活性成分之量介於0.0001至500 g/100 m²、較佳0.001至20 g/100 m²範圍內。

【0138】 對於例如藉由葉面施用來用於處理稻植物，本發明之活性成分的施用率可在每公頃0.0001 g至4000 g、例如每公頃1 g至2 kg或每公頃1 g至750 g、理想地每公頃1 g至100 g、更理想地每公頃10 g至50 g、例如每公頃10至20 g、每公頃20至30 g、每公頃30至40公克或每公頃40至50 g範圍內。

【0139】 本發明化合物特別適用於種子的處理，以保護種子免遭害

蟲，尤其土壤生活的害蟲，且所得幼苗之根及芽抵抗土壤有害生物及葉面昆蟲。因此，本發明亦關於保護種子免遭昆蟲、尤其土壤昆蟲及保護幼苗之根及芽免遭昆蟲、尤其土壤及葉面昆蟲之方法，該方法包含在播種前及/或在催芽後用本發明化合物處理種子。保護幼苗之根及芽為較佳的。更佳為保護幼苗之芽免遭刺吸昆蟲、咀嚼昆蟲及線蟲。

【0140】 術語「種子處理」包含此項技術中已知的所有適合之種子處理技術，諸如拌種、種子包衣、種子撒粉、種子浸泡、種子丸化及犁溝施用方法。較佳地，活性化合物之種子處理施用係在植物播種之前及在植物出苗之前藉由噴灑或藉由撒粉來進行。

【0141】 本發明亦包含包覆有或含有活性化合物之種子。術語「包覆有及/或含有」一般表示活性成分在施用時大部分在繁殖產品之表面上，儘管成分之更多或更少部分可滲透至繁殖產品中，視施用方法而定。當(再)種植該繁殖產品時，其可吸收活性成分。

【0142】 在本發明之上下文中，種子為稻種子。本發明之活性化合物亦可用於處理來自植物之種子，該等植物已藉由突變誘發或基因工程改造修飾，且其例如耐受除草劑或殺真菌劑或殺昆蟲劑之作用。此類經修飾之植物已詳細描述於上文。

【0143】 習知種子處理調配物包括例如可流動的濃縮物FS、溶液LS、懸乳劑(SE)、用於乾燥處理之粉劑DS、用於漿料處理之水分散性粉劑WS、水溶性粉劑SS及乳液ES及EC以及凝膠調配物GF。此等調配物可經稀釋或未經稀釋即施用於種子。施用於種子係在播種之前直接在種子上或在種子催芽之後進行。較佳地，施用調配物使得不包括萌發。

【0144】 可在二至十倍稀釋後獲得之即用調配物中的活性物質濃度

較佳為0.01至60重量%、更佳0.1至40重量%。

【0145】 在一個較佳實施例中，FS調配物用於種子處理。通常，FS調配物可包含1-800 g/l活性成分、1-200 g/l界面活性劑、0至200 g/l防凍劑、0至400 g/l黏合劑、0至200 g/l顏料及至多1公升溶劑，較佳水。

【0146】 用於種子處理之本發明化合物的尤其較佳的FS調配物通常包含0.1至80重量% (1至800 g/l)活性成分，0.1至20重量% (1至200 g/l)至少一種界面活性劑，例如0.05至5重量%濕潤劑及0.5至15重量%分散劑，至多20重量%、例如5至20%防凍劑，0至15重量%、例如1至15重量%顏料及/或染料，0至40重量%、例如1至40重量%黏合劑(黏著劑)，視情況至多5重量%、例如0.1至5重量%增稠劑，視情況0.1至2%消泡劑，及例如0.01至1重量%之量的視情況選用之防腐劑，諸如殺生物劑、抗氧化劑或其類似物，以及至多100重量%之填料/媒劑。

【0147】 在種子處理中，本發明化合物之施加率一般為每100 kg種子0.1 g至10 kg，較佳每100 kg種子1 g至5 kg，更佳每100 kg種子1 g至1000 g且尤其每100 kg種子1 g至200 g，例如每100 kg種子1 g至100 g或5 g至100 g。

【0148】 因此，本發明亦關於包含如本文所定義之本發明化合物或鹽農業上有用之鹽的種子。本發明化合物或其農業上有用之鹽的量一般在每100 kg種子0.1 g至10 kg、較佳每100 kg種子1 g至5 kg、尤其每100 kg種子1 g至1000 g之範圍內變化。

【0149】 在本發明中，本發明化合物亦可用於改善植物之健康。因此，本發明亦關於一種用於改善植物健康之方法，其係藉由用有效且無植物毒性量之本發明化合物處理稻植物、稻植物繁殖材料及/或稻植物生長

或將要生長之所在地。

【0150】 如本文所用，「有效且無植物毒性量」意指化合物之使用量允許獲得所需效應，但不會在經處理之植物上或在自經處理之繁殖體或經處理之土壤生長的植物上產生任何植物毒性症狀。

【0151】 術語「植物」及「植物繁殖材料」如上文所定義。

【0152】 「植物健康」定義為植物及/或其產品之條件，其係藉由單獨的數個態樣或彼此組合來確定，諸如產量(例如增加生物質量及/或增加有價值的成分的含量)、品質(例如改良某些成分之含量或組成或存放期)、植物萌發勢(例如改良植物生長及/或葉子更綠(「綠化效果」)、對非生物(例如乾旱)及/或生物脅迫(例如疾病)之抗性及生產效率(例如收穫效率、可加工性)。

【0153】 上述確定的植物健康狀況指標可相互依賴且可由彼此產生。各指標在此項技術中加以定義且可藉由技術人員已知的方法確定。

【0154】

實例

化合物I [3-(2-氯噻唑-5-基)-8-甲基-7-側氧基-6-苯基-2,3-二氫噻唑并[3,2-a]嘧啶-8-鎘-5-醇鹽]係如EP17164175.6中所述合成，且亦如其中所述分離成對映異構體I-R-1及I-S-1。

【0155】

步驟1：2-氯-N-甲氧基-N-甲基-乙醯胺

將N-甲氧基甲胺鹽酸鹽(345 g)及水(1.5 L)冷卻至0°C。向此反應混合物中分批添加K₂CO₃ (1466 g)，隨後在0°C下添加甲基第三丁基醚(1000 mL)。將反應混合物冷卻至-5°C。在-5°C至0°C下逐滴添加含氯乙醯氯

(400 g)之甲基第三丁基醚(500 ml)，且在0°C下攪拌2小時。使反應混合物達到20-25°C。自有機層獲得呈白色固體狀之所需產物(438 g，90%產率；98.45% HPLC純度)。

【0156】

步驟2：2-氯-1-(2-氯噻唑-5-基)乙酮

在氮氣氛圍下，將含2-氯噻唑(187 ml)之750 ml四氫呋喃冷卻至-20°C。逐滴添加氯化異丙基鎂x LiCl (1684 ml，1.3莫耳於四氫呋喃中)且在-20°C下攪拌60分鐘。在-20°C至-25°C下逐滴添加2-氯-N-甲氧基-N-甲基-乙醯胺(250 g)於四氫呋喃中之溶液。將反應混合物在-20°C下攪拌90分鐘。在-20°C下添加飽和氯化銨水溶液，隨後使反應混合物達到20-25°C。分離兩相且用乙酸乙酯萃取水相。自合併之有機層獲得呈深棕色油狀之所需粗產物，將其用含活性炭及二氧化矽之甲基第三丁基醚處理，得到呈淺棕色油狀之粗產物(335 g)，直接用於下一步驟。

【0157】

步驟3：N-[2-氯-1-(2-氯噻唑-5-基)亞乙基]-2-甲基-丙烷-2-亞磺醯胺

在20-25°C下，在氮氣氛圍下，向含粗物質2-氯-1-(2-氯噻唑-5-基)乙酮(335 g)之四氫呋喃中添加第三丁基亞磺醯胺(206 g)及Ti(OEt)₄ (396 ml)。將混合物加熱至50°C且攪拌2小時，隨後冷卻至20-25°C且用乙酸乙酯稀釋。在添加水之後，將混合物攪拌30分鐘，隨後過濾。蒸發有機相，獲得呈棕色油狀之所需粗產物。在用含活性炭及二氧化矽之甲基第三丁基醚處理之後，獲得呈淺棕色油狀之粗產物(365 g)，直接用於下一步驟。

【0158】

步驟4：N-[2-氯-1-(2-氯噻唑-5-基)乙基]-2-甲基-丙烷-2-亞磺醯胺

在-5°C下，向含N-[2-氯-1-(2-氯噻唑-5-基)亞乙基]-2-甲基-丙烷-2-亞磺醯胺(365 g)之四氫呋喃及甲醇中逐批添加NaBH₄ (23 g)且攪拌30分鐘。在0°C下添加飽和氯化銨水溶液。在用乙酸乙酯萃取後，有機層產生呈棕色油狀之所需粗產物(310 g)。

【0159】

步驟5：2-氯-1-(2-氯噻唑-5-基)乙胺鹽酸鹽

在20-25°C下，將N-[2-氯-1-(2-氯噻唑-5-基)乙基]-2-甲基-丙烷-2-亞磺醯胺與含HCl之甲醇(1 mol, 620 mL)一起攪拌12小時。在真空下移除甲醇，產生淺黃色黏性固體(244 g)，其用甲基第三丁基醚且隨後用乙酸乙酯洗滌，得到淺黃色固體(78 g，經步驟2至5之26%產率，>98%純度)。

【0160】

步驟6：4-(2-氯噻唑-5-基)-N-甲基-噻唑啉-2-亞胺

在23°C下，將含2-氯-1-(2-氯噻唑-5-基)乙胺鹽酸鹽(285 g)之甲基第三丁基醚及2莫耳NaOH水溶液(1060 mL)攪拌20分鐘。有機層產生呈淺棕色油狀之游離胺(230 g)。

【0161】含胺(230 g)之乙醇與三乙胺NEt₃ (351 ml)及Me-NCS (143.2 g)在22至25°C下反應18小時。濃縮反應物料，獲得棕色殘餘物，向其中添加NaOH水溶液(114 g於920 mL水中)。將所得混合物加熱至100°C持續2小時，隨後冷卻至20-25°C且用水稀釋。在用乙酸乙酯萃取後，有機層產生呈棕色固體狀之粗物質4-(2-氯噻唑-5-基)-N-甲基-噻唑啉-2-亞胺(256 g)，其與含20%乙酸乙酯之庚烷(300 mL)一起攪拌30分鐘。在過濾後，獲得呈棕色固體狀之產物(245 g，85%產率)。

【0162】

步驟7：3-(2-氯噻唑-5-基)-8-甲基-7-側氧基-6-苯基-2,3-二氫噻唑并[3,2-a]嘧啶-8-鎘-5-醇鹽(I-1)

在110至115°C下攪拌含4-(2-氯噻唑-5-基)-N-甲基-噻唑啶-2-亞胺(110 g)之甲苯。在添加2-苯基丙二酸雙(4-氯苯基)酯(226 g)後，將反應混合物在此溫度下攪拌2小時，隨後冷卻至40至45°C。在真空下移除甲苯後，獲得棕色固體，將其用甲基第三丁基醚濕磨，獲得黃色固體。

【0163】 在22至25°C下在甲基第三丁基醚(1 L)中攪拌14小時，產生淺黃色固體(160 g)。藉由溶解於二氯甲烷中且用甲基第三丁基醚沈澱進一步純化，產生呈淺黃色細粉狀之所需產物(129 g，80%產率)。

【0164】

分離對映異構體：

R-3-(2-氯噻唑-5-基)-8-甲基-7-側氧基-6-苯基-2,3-二氫噻唑并[3,2-a]嘧啶-8-鎘-5-醇鹽及

S-3-(2-氯噻唑-5-基)-8-甲基-7-側氧基-6-苯基-2,3-二氫噻唑并[3,2-a]嘧啶-8-鎘-5-醇鹽

【0165】 來自實例之3-(2-氯噻唑-5-基)-8-甲基-7-側氧基-6-苯基-2,3-二氫噻唑并[3,2-a]嘧啶-8-鎘-5-醇鹽之對映異構體可藉由製備型對掌性超臨界流體層析分離。分離126 g rac-3-(2-氯噻唑-5-基)-8-甲基-7-側氧基-6-苯基-2,3-二氫噻唑并[3,2-a]嘧啶-8-鎘-5-醇鹽。此舉在滯留時間1.94 min產生53.4 g R-3-(2-氯噻唑-5-基)-8-甲基-7-側氧基-6-苯基-2,3-二氫噻唑并[3,2-a]嘧啶-8-鎘-5-醇鹽及在滯留時間1.41 min產生57.7 g S-3-(2-氯噻唑-5-基)-8-甲基-7-側氧基-6-苯基-2,3-二氫噻唑并[3,2-a]嘧啶-8-鎘-5-

醇鹽。此等滯留時間參考下文列舉之分析方法。藉由X射線分析來確定對掌性中心之組態。

【0166】 分析型分離方法：

儀器：Thar分析型SFC

管柱：Chiralpak AS-H, 150×4.6 mm i.d., 5 u

移動相：A為CO₂且B為MeOH，梯度：B%=40%

流動速率：4.0 mL/min，背壓：100巴，管柱溫度：35°C

波長：220 nm

【0167】 製備型分離方法：

儀器：Thar 80製備型SFC

管柱：Chiralcel OJ-H, 250×30 mm I.D. 5 u

移動相：A為CO₂且B為CH₃CN，梯度：B% = 50%

流動速率：80 g/min，背壓：100巴，管柱溫度：40°C

波長：220 nm

循環時間：6.5 min

樣品製備：將外消旋物質溶解於MeOH-CH₃CN-DCM (1:1:0.5)之混合溶液中至20 mg/mL，且經由孔徑為0.45 um之膜過濾。

注射：每次注射4 mL。

【0168】 在分離後，將溶離份經由旋轉蒸發器在浴溫35°C下乾燥，得到兩種對映異構體。

*：HPLC方法：滯留時間(分鐘)；質荷比m/z

HPLC方法A：

MSD4/5: Shimadzu Nexera UHPLC + Shimadzu LCMS 20-20, ESI

管柱：Phenomenex Kinetex 1.7 μ m XB-C18 100A, 50 x 2,1mm

移動相：A：水+ 0.1%三氟乙酸；B：乙腈，溫度：60 $^{\circ}$ C

梯度：在1.50min內5% B至100% B；100% B 0.25min

流速：在1.51 min內0.8 ml/min至1.0 ml/min

MS方法：ESI陽性，質量範圍(m/z)：100-700

HPLC方法B：

MSD4/5: Shimadzu Nexera UHPLC + Shimadzu LCMS 20-20, ESI

管柱：Agilent Eclipse Plus C18, 50mm x 4.6mm x 3

移動相：A=10 mM甲酸銨(0.1%甲酸)，B=乙腈(0.1%甲酸)，流速=1.2 ml/min。管柱烘箱：30 $^{\circ}$ C

梯度：= 10% B至100% B - 1.5min，保持1min，2.51min - 10% B；

運行時間= 3.50 min

【0169】

生物測試：

B.1 稻水象甲

【0170】 微量小區試驗(秧苗盒施用)：在水稻秧苗移植之前，將產品之粒狀調配物人工且均勻地施用於秧苗盒。在田間小區中人工移植幼苗(模擬常用的機械移植)。使用2%的粒狀I。稻水象甲在田間自然浸染。在26 DAT/DAP估計攝食損害且以10個小丘之平均值表示。幼蟲計數為5個小丘/小區。用 Student-Newman-Keuls 分析資料 (P=0.05)。處於26 DAT/DAP之陰性對照物的攝食損害為3.3%且處於68DAT/DAP之陰性對照物的稻水象甲平均幼蟲數量為29個。

【0171】 結果(表1)顯示，測試之式I化合物經由粒狀秧苗盒施用顯

示出針對稻水象甲的優異活性。

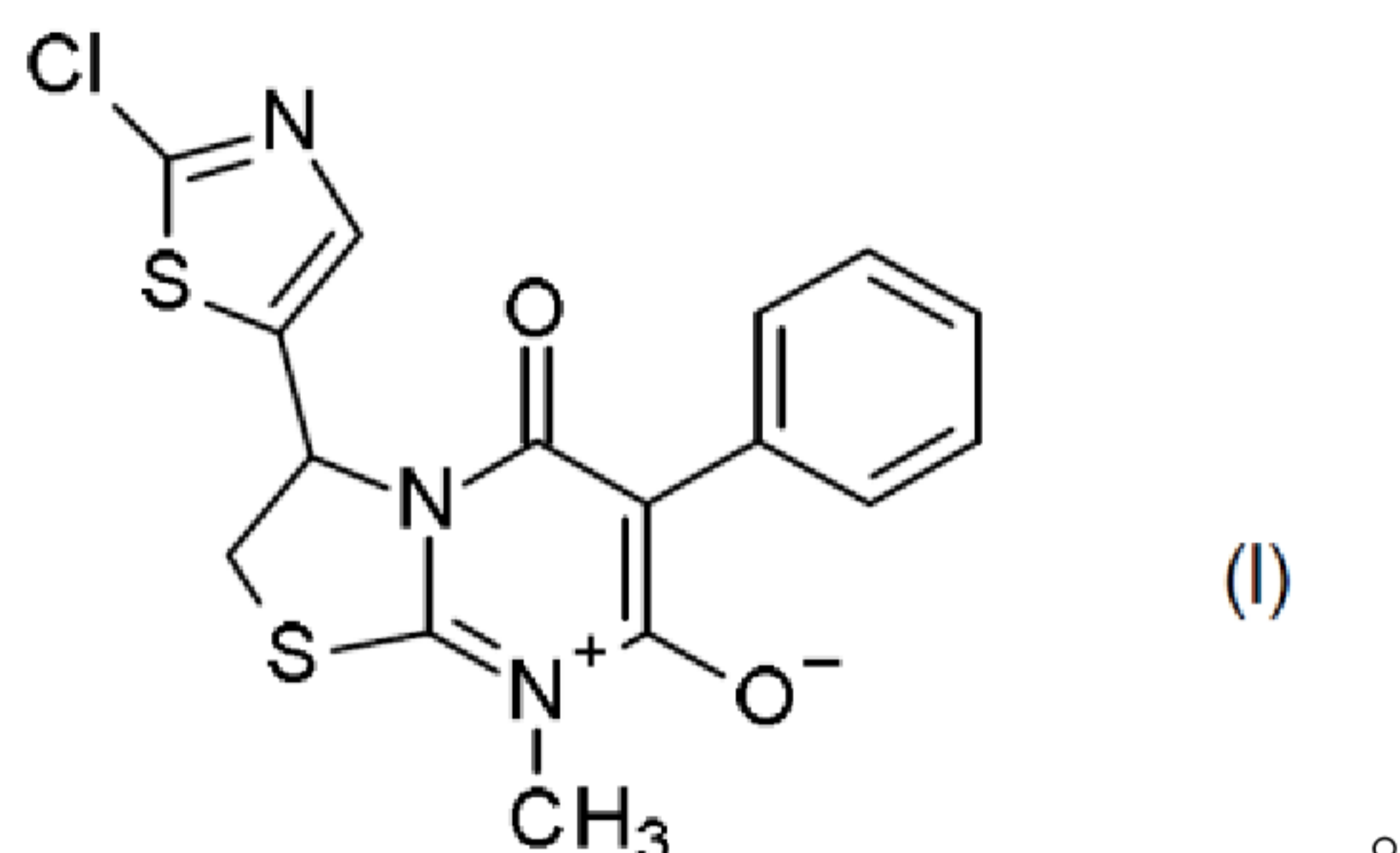
表1：I-1藉由粒狀秧苗盒施用對稻水象甲(稻象甲)之功效

產品	比率(g. ai/ha)	%攝食保護	%幼蟲控制
I-1	200	93 ^a	99 ^a

【發明申請專利範圍】

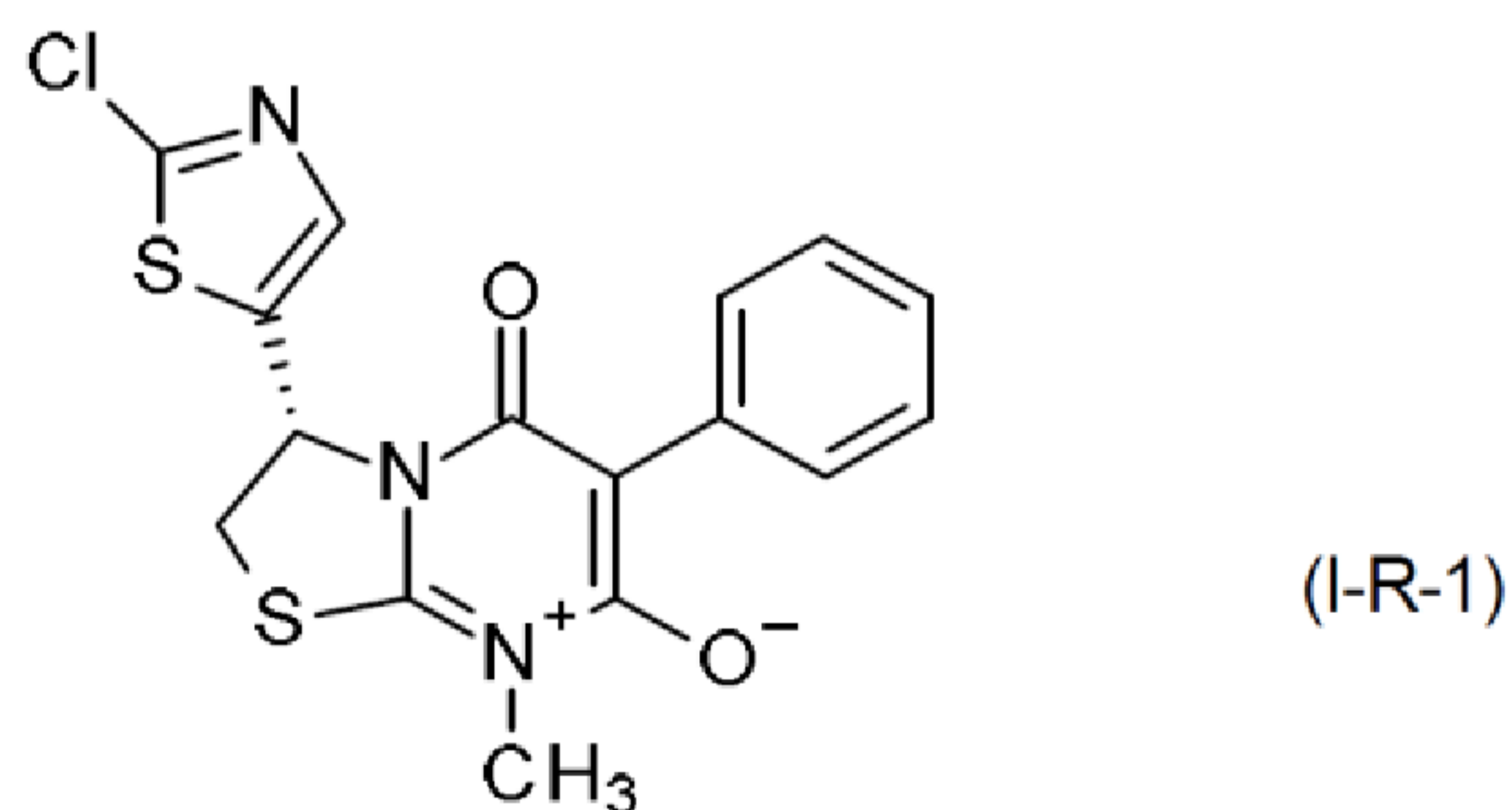
【第1項】

一種控制稻中之稻有害無脊椎動物的方法，該方法包含藉由秧苗盒施用向該等稻有害無脊椎動物施用式(I)化合物、其鹽或N-氧化物



【第2項】

如請求項1之方法，其中該式I化合物為化合物I-R-1



【第3項】

如請求項1或2之方法，其中該式I化合物係與至少一種其他殺有害生物劑混合施用。

【第4項】

如請求項1或2之方法，其中該稻有害無脊椎動物係選自以下之群：

半翅目：

褐飛虱 - 褐稻虱(*Nilaparvata lugens*)

灰飛虱 - 斑飛虱(*Laodelphax striatellus*)

白背飛虱 - 白背飛虱(*Sogatella furcifera*)

白葉蟬 - 白翅褐脈葉蟬(*Cofana spectra*)

青葉蟬 - 二點黑尾葉蟬(*Nephotettix virescens*)、黑條黑尾葉蟬(*N. nigriceps*)、黑尾葉蟬(*N. cincticeps*)、馬來亞黑尾葉蟬(*N. malayanus*)

電光葉蟬 - 電光葉蟬(*Recilia dorsalis*)

玉米橙葉蟬 - 二星葉蟬(*Cicadulina bipunctata*)

紫莞葉蟬 - 紫苑點葉蟬(*Macrosteles fascifrons*)

稻穗蝽，大稻緣蝽(*Leptocorisa oratorius*)，稻蛛緣蝽(*L. acuta*)

稻褐蝽 - 稻綠蝽(*Nezara viridula*)、異曼蝽(*Pygomenida varipennis*)、二星蝽屬(*Eysarcoris*)、*Tibraca limbatriventris*、廣二星蝽(*Eysarcoris ventralis*)

小臭蟲 - 雜色稻椿(*Oebalus poecilus*)、美洲稻椿(*O. pugnax*)

緣蝽 - 二星蝽屬

長蝽 - 麥長蝽(*Blissus leucopterus leucopterus*)

水稻粉蚧，水稻粉紅粉蚧(*Brevennis rehi*)，亞蔗粉蚧(*Pseudococcus saccharicola*)

稻蚜，紅腹縊管蚜(*Rhopalosiphum rufiabdominalis*)，麥長管蚜(*Macrosiphum avenae*)，無肘詠蚜(*Hysteroneura setariae*)，黑腹四脈綿蚜(*Tetraneuro nigriabdominalis*)

菜豆根蚜 - 棉根蚜(*Smynthuroides betae*)

鱗翅目：

稻苞蟲 - 直紋稻弄蝶(*Parnara guttata*)、暮眼蝶(*Melanitis leda ismene*)

水稻螟蟲/條螟 - 二化螟(*Chilo suppressalis*)、黑頭條紋螟(*Chilo polychrusus*)、斑禾草螟(*Chilo partellus*)、七星稻螟(*Chilo plejadellus*)

- 稻稈螟 - 稻多麗螟(*Chilo traea polychrysa*)
- 大螟 - 大螟(*Sesamia inferens*)
- 三化螟 - 三化螟(*Tryporyza (=Scirpophaga) incertulas*)
- 稻白螟 - 稻白螟(*Tryporyza innotata*)
- 稻縱卷葉螟/卷葉蟲 - 稻縱卷葉野螟(*Cnaphalocrocis medinalis*)、寬
紋刷鬚野螟(*Marasmia patnalis*)、稻顯紋刷鬚野螟(*M. exigua*)
- 荊枝蟲/行軍蟲- 東方黏蟲(*Pseudaletia separate*)
- 綠毛蟲 - 犁紋黃夜蛾(*Xanthodes transversa*)
- 稻綠毛蟲 - 稻螟蛉(*Narnaga aenescens*)
- 綠角毛蟲 - 暮眼蝶、眉眼蝶屬(*Mycalesis sp*)
- 草地黏蟲 - 草地貪夜蛾(*Spodoptera frugiperda*)
- 切根蟲 - 黏蟲(*Mythimna separata*)
- 稻殼蟲- 稻三點螟(*Nymphula depunctalis*)
- 黑毛毛蟲，鹿蛾屬(*Amata sp.*)
- 長毛毛蟲- 實毛脛裳蛾(*Mocis frugalis*)
- 黃毛蟲，鈎茸毒蛾(*Psalis pennatula*)
- 水稻半褐尺蠖，實毛脛裳蛾
- 水稻擬尺蠖，金色雙斑蛾(*Chrysodeixis chalcites*)
- 草螟 - 水稻切葉野螟(*Herpetogramma licarsisalis*)
- 蔗螟 - 小蔗螟(*Diatraea saccharalis*)
- 玉米稈螟 - 南美玉米苗斑螟(*Elasmopalpus lignosellus*)
- 條紋草尺蠖 - 南美毛脛夜蛾(*Mocis latipes*)
- 歐洲玉米螟 - 玉米螟(*Ostrinia nubilalis*)

墨西哥稻螟 - 墨西哥水稻螟(*Eoreuma loftini*)

鞘翅目：

水稻象鼻蟲 - 稻水象甲(*Lissorhopterus oryzophilus*)

稻象鼻蟲 - 稻象甲(*Echinocnemus squamous*)

米象 - 水稻負泥蟲(*Oryzophagus oryzae*)

水稻鐵甲蟲 - 水稻鐵甲(*Diclodispa armigera*)

水稻葉甲 - 稻葉甲(*Oulema oryzae*)

稻黑蝽 - 稻黑蝽(*Scotinophora vermidulate*、*S. vermidulate*、*S. lurida*)、寬翅黑蝽(*S. latiuscula*)

水稻跳甲 - 黑凹脛跳甲(*Chaetocnima basalis*)

蛆 - 白鱗鰓金龜(*Leucopholis irrorata*)、白鱗鰓金龜、鰓角金龜屬(*Phyllophaga* sp)、異爪犀金龜屬(*Heteronychus* sp)

金龜子 - 阿根廷兜蟲(*Diloboderus abderus*)

象鼻蟲 - 尖隱喙象屬(*Sphenophorus* spp)

葡萄鞘葉甲 - 葡萄鞘葉甲(*Colaspis brunnea*)、路易斯安那葉甲(*C. louisianae*)

水稻花粉甲蟲，花金龜(*Chilolaba acuta*)

雙翅目：

稈蠅 - 稻稈潛蠅(*Chlorops oryzae*)

潛蠅 - 日本稻潛蠅(*Agromyza oryzae*)

稻水蠅/稻稈蠅 - 稻莖毛眼水蠅(*Hydrellia sasakii*)

稻水蠅/稻小潛蠅 - 稻潛葉蠅(*Hydrellia griseola*)

稻癭蚊 - 稻癭蚊(*Orseolia (=Pachydiplosis) oryzae*)

秧苗蠅- 稻芒蠅(*Atherigona oryzae*)

稻搖蚊 - *Chironomus cavazzai*、搖蚊屬(*Chironomus spp*)、環足搖蚊屬(*Cricotopus spp*)

纓翅目：

稻薊馬 - 稻薊馬 (*Chloethrips oryzae*)、稻直鬃薊馬 (*Stenochaetothrips biformis*)、裸薊馬屬(*Perrisothrips sp.*)、器管薊馬屬 (*Hoplothrips sp.*)，

直翅目：

稻蝗、等岐蔗蝗(*Hieroglyphus banian*)、高粱蔗蝗(*Hieroglyphus nigrorepletus*)、紅褐斑腿蝗 (*Catantops pinguis*)、紡梭負蝗 (*Attractomorpha burri*)、短翅負蝗(*A. crenulate*)、柳枝負蝗(*A. psittacina psittacina*)、尖頭負蝗 (*A. Bedeli*)、無齒稻蝗 (*Oxya adenttata*)、*Oxya ebneri*、小稻蝗(*Oxya hyla intricata*)、長頭蝗(*Acrida turricata*)

蝗蟲 - 東亞飛蝗(*Locusta migratoria manilensis*)

螻蛄，非洲螻蛄(*Grylotalpa africana*)

蟋蟀：雙斑蟋(*Gryllus bimaculatus*)、烏頭眉紋蟋蟀(*Teleogryllus occipitalis*)、靈巧纖蟋(*Euscyrtus concinus*)

蝻斯 - 長翅草蝻(*Conocephalus longipennis*)

等翅目：

白蟻 - 暗黃大白蟻(*Macrotermes gilvus*)、*Syntermes molestans*

膜翅目：

螞蟻 - 熱帶火蟻(*Solenopsis geminata*)

稻幹尖線蟲 - 葉芽線蟲(*Aphelenchoides besseyi*)

蜉蝣亞綱：

稻穗蟊 - 稻細蟊(*Steotarsionemus pinki*)

甲殼綱：

蟹蟲 - 佳朋蟹蟲(*Triops longicaudatus*)、蟹形蟹蟲(*T. cancriformis*)

水稻小龍蝦 - 克氏原螯蝦(*Procambarus clarkii*)、莫里斯綠螯蝦(*Orconectes virilis*)。

【第5項】

如請求項1或2之方法，其中該稻有害無脊椎動物係來自半翅目、鱗翅目或鞘翅目；

較佳選自跳蟲，

或較佳選自褐飛虱(褐稻虱)、灰飛虱(斑飛虱)、白背飛虱(白背飛虱)、青葉蟬(二點黑尾葉蟬)、稻褐蝽(稻綠蝽、異曼蝽、二星蝽屬、*Tibraca limbatriventris*、廣二星蝽)、小臭蟲(雜色稻椿、美洲稻椿)、水稻螟蟲(二化螟)、三化螟(三化螟)；稻縱卷葉螟/卷葉蟲(稻縱卷葉野螟、寬紋刷鬚野螟、稻顯紋刷鬚野螟)、水稻象鼻蟲(稻水象甲)、米象(水稻負泥蟲)。

【第6項】

如請求項1或2之方法，其中該等有害生物係選自螟蟲(禾草螟屬(*Chilo* spp.))、飛虱(褐稻虱)、象鼻蟲(稻象甲(*Lissorhoptrus ory-zophilus*))、線蟲葉芽線蟲(*Aphelencoides besseyi*)及潛蠅菲律賓稻毛眼水蠅(*Hydrellia philippina*)。

【第7項】

一種用於增加尤其稻田中之稻植物之健康的方法，其包含藉由秧苗

盒施用來施用如請求項1至2中任一項所定義之式(I)化合物或如請求項3所定義之混合物。

【第8項】

一種用於增加稻植物之產量的方法，其包含藉由秧苗盒施用來施用如請求項1至2中任一項所定義之式(I)化合物或如請求項3所定義之混合物。

【第9項】

一種用於保護稻植物之秧苗盒施用方法，其使用如請求項1至2中任一項所定義之式(I)化合物或如請求項3所定義之混合物。

【第10項】

一種控制稻中之稻有害無脊椎動物的秧苗盒施用方法，該方法包含向該等稻有害無脊椎動物施用如請求項1至2中任一項所定義之式(I)化合物或如請求項3所定義之混合物。

【第11項】

如請求項1、2、7及8中任一項之方法，其中該式(I)化合物係以粒狀調配物形式施用。

【第12項】

一種秧苗盒，其包含如請求項1至2中任一項所定義之式(I)化合物或如請求項3所定義之混合物及稻種子。

【第13項】

如請求項12之秧苗盒，其中浸漬於該等稻種子中之式(I)化合物之量係介於約3及200 g/q之間。

【第14項】

一種育苗盒，其包含稻、稻種子之生長基質及如請求項1至2中任一項所定義之式(I)化合物或如請求項3所定義之混合物的水性調配物，以及稻種子。

【第15項】

如請求項12或13之秧苗盒或如請求項14之育苗盒，其中該式(I)化合物係以粒狀調配物形式施用。

【第16項】

一種如請求項12或13之秧苗盒的用途，其用於控制稻中之稻有害無脊椎動物。

【第17項】

一種如請求項14或15之育苗盒的用途，其用於控制稻中之稻有害無脊椎動物。