

公告本

86.7.19修正
年 月 日 補充

申請日期	85.12.17
案 號	85115590
類 別	C07D ^{26/10} , A01N ^{43/76}

(以上各欄由本局填註)

A4
C4

42K089

424089

發明專利說明書

一、發明名稱	中 文	噁唑啉殺節肢動物劑
	英 文	Oxazoline arthropodicides
二、發明人	姓 名	1. 傑佛瑞·隆 2. 湯瑪斯·馬丁·史蒂文生
	國 籍	1. 美國 2. 美國
	住、居所	1. 美國達拉威州維明頓淮爾大道9號 2. 美國達拉威州19702·乃沃克·艾洛奎斯廣場103號
三、申請人	姓 名 (名稱)	美商杜邦股份有限公司
	國 籍	美國
	住、居所 (事務所)	美國達拉威州一九八九八維明頓市場街一〇〇七號
	代 表 人 姓 名	馬瑞安·迪·麥克奈海

裝

訂

線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

24089

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大 類：
I P C 分類：

A6

B6

本案已向：

國(地區) 申請專利，申請日期： 案號： ，☐有 ☐無主張優先權

美國 1996 年 1 月 16 日 60/010,014 ☒無主張優先權

有關微生物已寄存於： ，寄存日期： ，寄存號碼：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

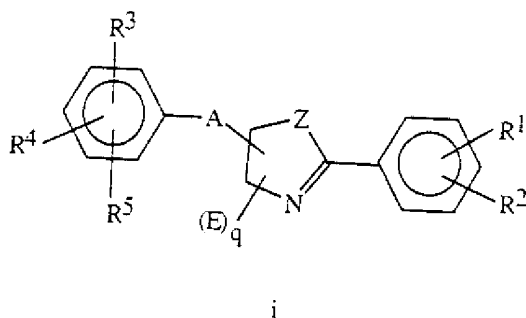
五、發明說明 (17)

發明之背景

本發明為有關特定之噁唑啉類化合物，它們在農業上適用之鹽類及組成物，及它們同在農業經營及非農業經營環境上用作殺節肢動物劑的方法。

為達成高的作物收成率，控制此節肢動物害蟲就非常地重要。節肢動物對生長及儲存之農經作物的破壞會造成產量顯著的減少，及因此造成對消費者價格的提高。節肢動物害蟲之控制對森林、溫室作物、裝飾植物、苗圃作物、儲存的食物及纖維產品、畜牧、家庭、公共場所及動物保健也同樣重要。商業上有許多產品可用於這些目的，但仍需要更有效、費用較低、較環保、毒性較弱或俱有不同反應形式的新化合物。

WO 95/04726 一般性地表示了化學式 I 之化合物：



其中：

A 為選自直接鍵結及 C₁-C₃直鏈或支鏈烯基之基團；

E 為選自基團 C₁-C₄烷基及 C₁-C₄鹵烷基；

Z 為選自基團 O 及 S；且

R¹及 R²為獨立選自基團 H、鹵素、C₁-C₆烷基、C₁-C₆

(請先閱讀背面之注意事項再填本頁)

裝

訂

線

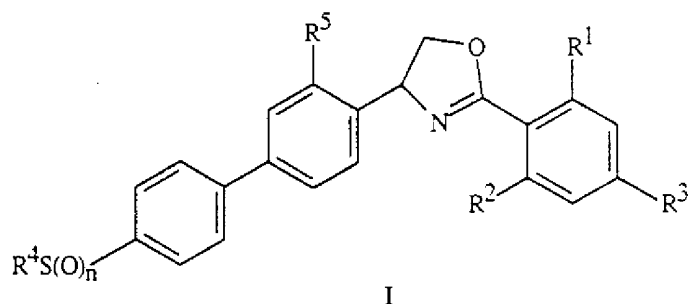
五、發明說明(2)

鹵烷基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_1-C_6 硫烷基、CN及 NO_2 。

本發明之化合物出人意外地比W0 95/04726所命名者更有效、更環保、及毒性較弱。

發明之摘要

本發明為有關化學式 I 之化合物，包括所有幾合及立體異構物、關於它的農業上適用之鹽類、包含它們的農業組成物及其殺節肢動物劑之用途：



其中：

R^1 是 H、F、或 Cl；

R^2 是 F 或 Cl；

R^3 是 H 或 F；

R^4 是 C_1-C_2 鹵烷基；

R^5 是 H、F、Cl、 C_1-C_2 烷基、或 C_1-C_2 烷氧基；且

n 是 0、1、或 2；

倘若

i) 當 R^2 是 F， R^3 及 R^5 是 H，及 n 是 0，然後 R^4 不是 CF_3 ；

ii) 當 R^1 是 F， R^2 是 Cl， R^3 及 R^5 是 H，及 n 是 0，然後 R^4

(請先閱讀背面之注意事項再填為本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (3)

不是 CF_3 。

在上面的敘述中，"烷基"一詞，單獨使用或用於複合字像"鹵烷基"，包括了甲基及乙基。"烷氧基"包括了甲氧基及乙氧基。

"鹵素"一詞，單獨或用於複合字像"鹵烷基"包括了氟、氯、溴或碘。而且，當用於複合字中像"鹵烷基"，即烷基可部份或完全被相同或不同之鹵素原子所取代。"鹵烷基"之範例包括 F_3C 、 ClCH_2 、 CF_3CH_2 及 CF_3CCl_2 。

於一取代基團中碳原子的總數是以 " $\text{C}_i\text{-C}_j$ " 詞頭來表示，其中 i 及 j 為數字從 1 到 2。例如， $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基指定為甲基及乙基，及 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷氧基指定為 CH_3O 及 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$ 。

當一基團包含一可為氫之取代基，例如 R^1 或 R^5 ，然後，當以氫為此取代基時，則認定此相當於所謂的未被取代之基團。

本發明之化合物可以一或多個立體異構物存在。這些不同立體異構物包括左右對稱體、非對映體、atropisomers 及幾何異構物。熟於此技藝之人仕會瞭解有的立體異構物會較有活性，及或當添加於其它立體異構物或自其它立體異構物分離出時，將俱備有利的效果。

此外，熟於此技藝之人仕知道如何分離、添加、及或選擇性地製備所謂的立體異構物。因此，本發明包含選自化學式 I 之化合物及其農業上適用之鹽類。本發明之化合物可以立體異構物之混合物、單獨立體異構物、或以一

(請先閱讀背面之注意事項再填本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(4)

光學上活躍的形式存在。

本發明之化合物的鹽包括加無機或有機酸所得的鹽像氫溴酸、鹽酸、硝酸、磷酸、硫酸、醋酸、丁酸、反丁烯二酸、乳酸、順丁烯二酸、丙二酸、草酸、丙酸、水楊酸、酒石酸、4-甲苯磺酸或戊酸。當本發明之化合物含有酸性基團時，此化合物的鹽亦包括那些與有機鹼形成的鹽(例如，吡啶、氨、或三乙胺)或無機鹼(例如，氫化物、氫氧化物、或鈉、鉀、鋰、鈣、鎂或鋇的碳酸鹽)。

為著較好的活性、環境安全、毒性較弱及/或容易合成的因素，較佳的化合物為：

優先 1. 化學式 I 之化合物，及其農業上適用之鹽類
其中：

R^1 及 R^2 為 F；

R^3 為 H；且

R^4 為 CF_2H 、 CF_3 、 CF_2Br 、 CF_2CF_2H 、或 CF_2CF_3 。

優先 2. 上述化學式 I 之化合物，及其農業上適用之鹽
其中：

R^1 、 R^2 及 R^3 為 F；且

R^4 為 CF_2H 、 CF_3 、 CF_2Br 、 CF_2CF_2H 、或 CF_2CF_3 。

優先 3. 上述化學式 I 之化合物，及其農業上適用之鹽

其中： R^1 為 H；

(請先閱讀背面之注意事項再填本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (5)

R^2 爲 Cl ; 及 R^5 爲 H。

最佳的優先 3 之化合物爲選自下列化合物之中：

2-(2-氯苯基)-4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-
-鹽基]-4,5-二氫噁唑；

2-(2-氯苯基)-4-[4'-[(二氟甲基)亞磺鹽基][1,1'-二苯
基]-4-鹽基]-4,5-二氫噁唑；及

2-(2-氯苯基)-4-[4'-[(二氟甲基)磺鹽基][1,1'-二苯基]
-4-鹽基]-4,5-二氫噁唑。

優先 4. 優先 1 之化合物，其中：

R^5 爲 H。

優先 5. 優先 4 之化合物其中：

R^4 爲 CF_2H 、 CF_3 或 CF_2Br 。

優先 5 之化合物爲選自下列化合物之中：

4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-鹽基]-2-(2,6-
-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑；

4-[4'-[(二氟甲基)亞磺鹽基][1,1'-二苯基]-4-鹽基]-2-
(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑；

4-[4'-[(二氟甲基)磺鹽基][1,1'-二苯基)-4-鹽基]-2-(2,
6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑；

(-)-4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-鹽基]-2-
(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑；

(-)-4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-鹽基]-2-

(請先閱讀背面之注意事項再填本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (6)

(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑之亞礪，此亞礪其中有S結構；

(-)-4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-鹽基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑之亞礪，此亞礪其中有R結構；且

(-)-4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-鹽基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑之礪。

本發明亦有關於含有殺節肢動物上有效份量的此化學式 I 化合物之殺節肢動物性質之組成物，及至少一種的界面活性劑、一固態或液態稀釋劑。本發明之較佳的組成物為那些包含上述之較佳化合物。

本發明亦為有關於控制節肢動物之方法，包括以一殺節肢動物上有效份量的此化學式 I 化合物(例如，以一在此所述之組成物)接觸此節肢動物或其生長環境。較佳的使用法為那些包含上述之較佳化合物者。

發明之詳細說明

此化學式 I 之化合物可藉由一或多種下列方法及如簡圖 1-3 中所述之變化來製備。R¹-R⁵及 n 在下列化學式 I-VII 之化合物中的定義，為如上面在發明之摘要中所定義者。

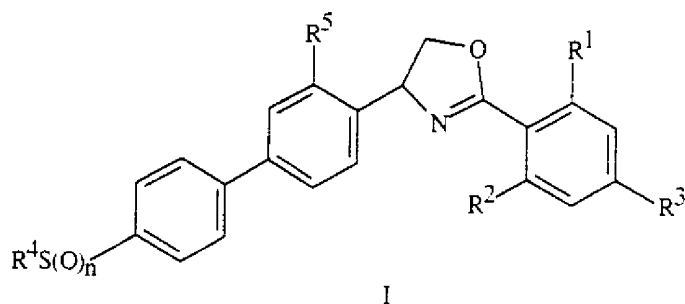
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

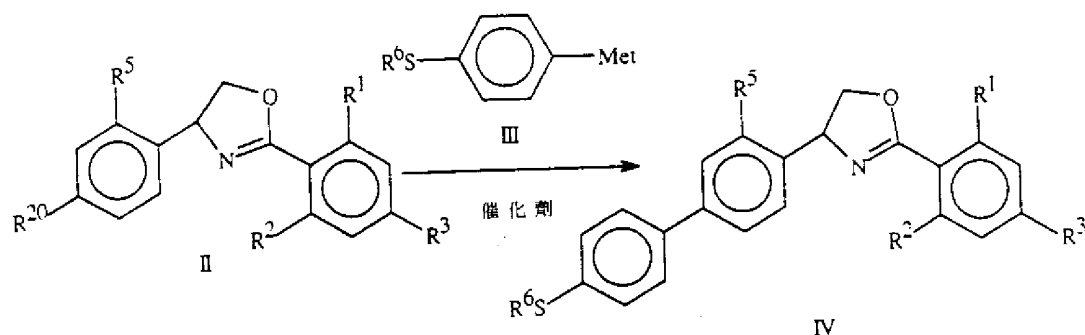
五、發明說明(7)



在本發明中用作有效成份之化學式 I 之化合物，例如，可藉由下列各簡圖中所示和化學式 II 之化合物之反應步驟來製備。化學式 II 之中間產物（例如，2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-4-(4-碘苯基)噁唑，其為化學式 II 之化合物其中 $R^1 = F$ ， $R^2 = F$ ， $R^3 = H$ ， $R^4 = H$ ，及 $R^{20} = I$ ）可藉由在 W0 95/04726 中所述之方法來製備。簡圖 1 之反應為與一過渡金屬催化劑進行於 $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$ 至選自四氫呋喃 (THF)、乙醚、己烷、甲苯，等鈍性溶劑之沸點，30 分鐘至 72 小時之久，例如，雙(1,2-二苯基膦基乙烷)氯化鎳 (II)、四(三苯基次膦酸)鈮 (0)、雙(三苯基次膦酸)氯化鈮 (II)、或醋酸鈮 (II) 與，例如，三-對-甲苯基次膦酸或三苯基膦，且有或無添加輔助物質，例如，氯化鋰、碘化亞銅 (I)、或二烷基-或三烷基胺，以得到化學式 IV 之化合物。

五、發明說明(8)

簡圖 1



$R^6 = R^4$ 或一保護基團，

$R^{20} = I, Br, OSO_2CF_3, OSO_2F$ ，等，

$Met = MgX, ZnX$ ($X = Cl, Br, I$)，

$SnMe_3, SnBu_3, B(OH)_2$ ，等

化學式 III 之中間產物是藉由此技藝中已知之製程來製備。 R^6 可等於 R^4 ，此情況下化學式 I 之化合物為直接得到，或 R^6 依便於合成的需要，可以是一硫-保護基團像，例如，*t*-丁基二甲基甲矽烷基、*t*-丁基、*p*-甲氧基苯甲基，等。

若 R^6 是保護基團，化學式 I 之化合物是藉由去掉硫的保護及之後的反應來製備，如簡圖 2 中所示。化學式 V 之中間產物的反應可選擇性地進行於選自四氫呋喃 (THF)、二氧雜環己烷、乙醚、二氯甲烷、己烷、甲苯，等鈍性溶劑中，於 $-20^\circ C$ 至溶劑之沸點 5 分鐘至 72 小時之久。與一碳氫鹵化合物反應，像氯二氟甲烷、氯仿，等，及鹼，像氫氧化鈉、氫氧化鉀、*t*-丁氧化鉀，等，可或有一轉相催化劑存在，或，另外與取代以一離去基團之碳氫鹵

(請先閱讀背面之注意事項再填)

裝

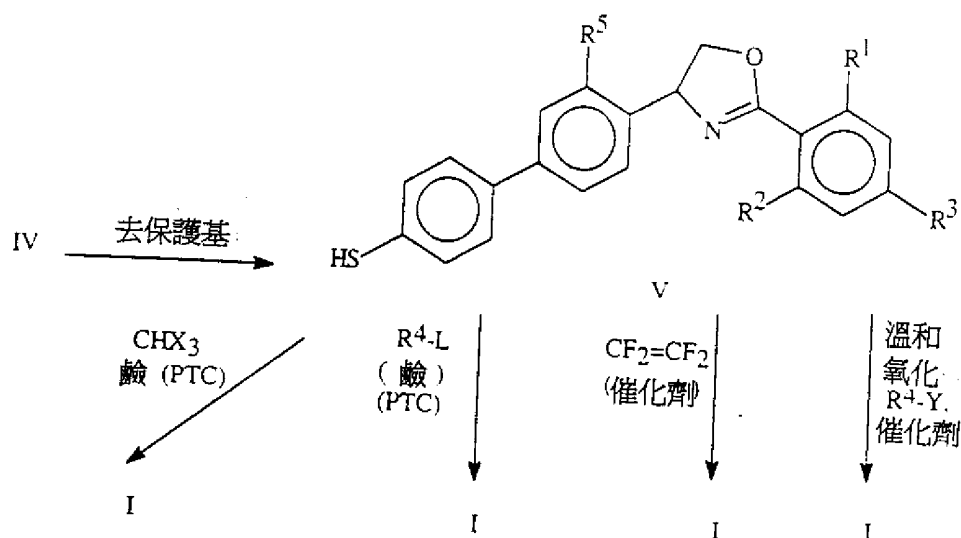
訂

線

五、發明說明(9)

或碳鹵化合物，此離去基團為碘、溴、氯、甲烷磺酸鹽、p-甲苯磺酸鹽，等，可或有一鹼存在，例如，氫化鈉、氫氧化鈉、氫氧化鉀、t-丁氧化鉀，等，及可或有一轉相催化劑存在，以得到化學式 I 之化合物。化學式 V 之化合物另外可與一活化烯反應，像四氟乙烯，可或有一鹼性、酸性、或自由基催化劑存在。另外，化學式 V 之硫醇可被氧化成二硫化物（見 p.1092 of Advanced Organic Chemistry, 3rd edition, J. March, (1985), John Wiley & Sons, New York)及與全鹵烷類及自由基引發劑反應轉換為化學式 I 之化合物（見，例如，C. Wakselman, et al, J. Chem. Soc., Chem. Commun., (1991), 993）。

簡圖 2



X = F, Cl, Br, I (可混合)

(請先閱讀背面之注意事項再填為本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (10)

Y = Cl, Br, I

PTC=相移轉催化劑，如 BnEt_3N^+ 或 Bu_4N^+ 鹽類，

L = 離去基 (見本文)

化學式 I 之化合物也可照簡圖 3 來製備。化學式 II 之化合物轉換為化學式 VI 之甲錫烷基衍生物 以其與例如，在金屬複合物，像四(三苯基次膦酸)鈮(0)、雙(三苯基次膦酸)氯化鈮(II)之催化下，與六甲基二甲錫烷之反應，或醋酸鈮(II)與，例如，三-對-甲苯基次膦酸、三苯基肅，等之反應，有或無加入輔助物質，例如，氯化鋰、碘化亞銅(I)、或二烷基-或三烷基胺，等。此化學式 VI 之甲錫烷基衍生物然後與化學式 VII 之芳香族衍生物反應於催化性金屬複合物存在下，像以上提到的那些以產生一化學式 IV 之化合物，其又為化學式 I 之化合物 ($\text{R}^6 = \text{R}^4$) 或，若 R^6 為一保護基團，便可藉簡圖 2 之化學反應轉換成化學式 I 之化合物。

(請先閱讀背面之注意事項再填本頁)

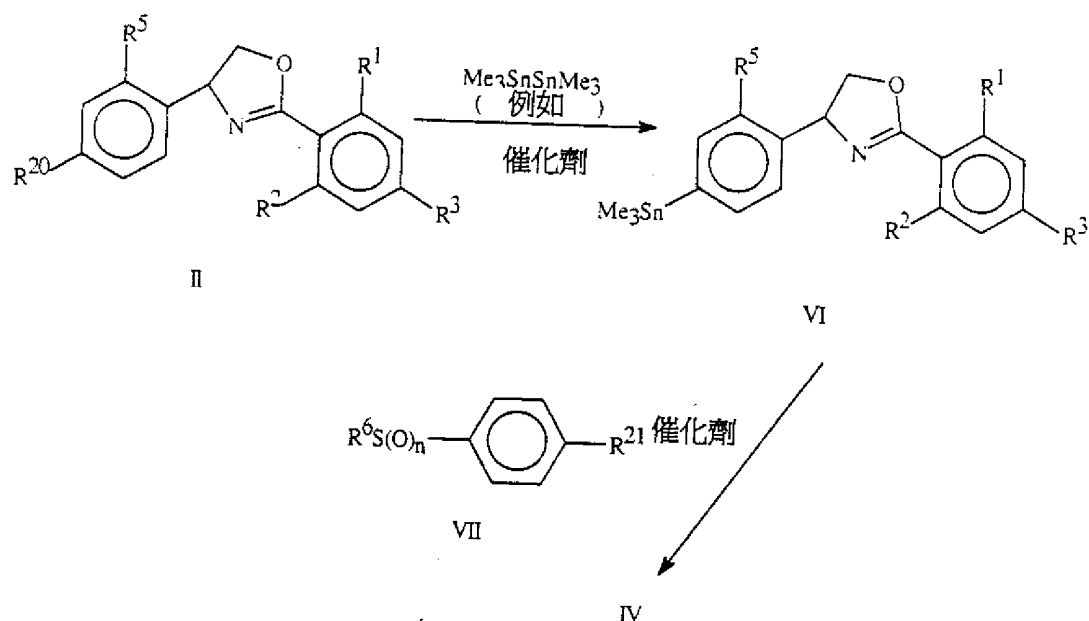
裝

訂

一線

五、發明說明(11)

簡圖 3



$\text{R}^6 = \text{R}^4$ 或保護基，

R^{20} = 如簡圖 1 所定義，

R^{21} = 獨立為如 R^{20} 所定義者，

$n = 0, 1, 2$ 。

此化學式 I 之化合物 其中 $n = 1$ 或 2 係製備自化學式 I 之化合物，其中 $n = 0$ 以一弱氧化劑作用，例如，有機過酸類化合物、過碘酸鈉，等（見，例如，之前提到的，March，pp.1089-1090，等）。另外，像那些化學式 VII 之中間產物，例如，其中 $n = 1$ 或 2 ，當 $n = 1$ 得到化學式 I 之產物，或藉簡圖 3 之化學反應得 2。

所欲得之產物可藉執行傳統反應後之步驟來製備，像萃取、過濾，及濃縮，及必要的話進一步用如層析及/或結晶的方式適當地純化。

五、發明說明 (12)

已知上述用來製備化學式 I 之化合物的一些試劑及反應情況可能無法與存在於中間產物之特定功能相容。在這些情況下，加入保護/去保護順序或官能基相互轉換成合成反應，將有助於得到所要的產物。熟於化學合成技藝之人仕將瞭解此保護基團之使用與選擇(見，例如，Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. Protective Groups in Organic Synthesis, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991)。

熟於此技藝之人仕將瞭解，在某些狀況下，如任一簡圖中所描述加入一試劑後，或許必須操作更多例行的未詳細描述之合成步驟以完成化學式 I 之化合物的合成反應。

熟於此技藝之人仕同時也會瞭解化學式 I 之化合物及此處所提之其中間產物可接受各種親電子、親核、自由基的、有機金屬化、氧化、及還原反應，以增加取代基或改良現有之取代基。在無進一步之詳細說明下，相信熟於此技藝之人仕在利用前面之敘述時會充份應用本發明。因此，下列實施僅作為本發明的例證而已。百分比為重量百分比，除了層析溶劑的混合物或另外指明。層析溶劑的混合物之份數及百分比除非另外提到則為容積百分比。¹H NMR 光譜係在四甲基甲矽烷低磁場以 ppm 表示；m = 多重譜線。

實施例 1

步驟 A: [(4-溴苯基)硫基]參(1-甲基乙基)甲矽烷之

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (13)

製備

將 53 mL 的三異丙基甲矽烷基氯及 38 mL 的 DBU (1, 8-重氮雙環[5.4.0]十一-7-烯)在氮氣下加入一 45 克 4-溴硫基酚溶於 250 mL THF 之溶液中。同時加熱此反應混合物至對流。讓此反應混合物冷卻且用 500 mL 己烷稀釋。所得之白色懸浮液用一片 Celite[®] (矽藻土)過濾，且此濾塊用更多己烷及 100 mL 乙醚洗過。此濾質用冰冷的 0.1 N HCl 液、水、NaHCO₃ 水溶液及飽合 NaCl 溶液洗過，用 MgSO₄ 乾燥，且在真空下濃縮以得到 82 克的如澄清油的步驟 A 之標題化合物。¹H NMR (CDCl₃, 300 MHz) δ 1.1 (m, 18H), 1.2 (m, 3H), 7.3-7.4 (m, 4H)。

步驟 B: 2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-4-[4'-[[參(1-甲基乙基)甲矽烷基]硫基][1,1'-二苯基]-4-醯基]噁唑之製備

步驟 A 之標題化合物 (4.3 g) 在氮氣下溶解於 15 mL THF，且將此反應混合物冷卻至 -65°C 以下，然後將 4.7 mL 的 2.5M n-鈣鋰/己烷溶液一滴滴加入。15 分鐘之後，將 26 mL 的 0.5 M 氯化鋅/THF 溶液一滴滴加入。另一反應三角瓶中，將 67 mg 的 Pd(OAc)₂ 加入 201 mg 的三(對-甲苯基)次膦酸溶於 5 mL THF 之溶液中，且在經由插管加入至主要的反應混合物之前攪拌此混合物 5 分鐘。將 3.85 g 的 2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-4-(4-碘苯基)噁唑 (如 WO 95/04726 所述來製備) 溶於 10 mL THF 之溶

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (14)

液加入，且讓此反應混合物回溫至室溫並攪動2到3小時。將此反應混合物倒入冰冷的NH₄Cl溶液，且用醋酸乙酯萃取。將其有機相用飽和NaCl溶液洗出，用MgSO₄乾燥，且在真空下濃縮。將此油狀殘餘加到矽膠管柱中而被吸附於矽膠上，並用己烷/醋酸乙酯(6:1 v:v)沖洗出以得到3.6 g 濃稠油狀的步驟B之標題化合物。¹H NMR (CDCl₃, 300 MHz) δ 1.1 (m, 18H), 1.3 (m, 3H), 4.3 (m, 1H), 4.8 (m, 1H), 5.5 (m, 1H), 7.0 (m, 2H), 7.3-7.5 (m, 5H), 7.5-7.6 (m, 4H)。

步驟 C: 4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-噻基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫嘔啶之製備

將23 mL 商業上的1.0 M n-Bu₄NF於THF之溶液(包含5%水)，在15至20 °C(水浴冷卻)及氮氣下加入10.9 g 步驟B之標題化合物於20 mL THF之溶液中。5分鐘之後，加入5.9 g 新鮮研磨的KOH，然後經由液面下試管，以一足以維持輕微過壓之速率加入超量的Freon® 22(氯二氟甲烷)。20至30分鐘之後，停止加氣，且將此反應混合物倒入冰冷的NH₄Cl溶液，且用醋酸乙酯萃取。將其有機相用飽和NaCl溶液洗出，用MgSO₄乾燥，且在真空下濃縮。此殘餘物加到矽膠管柱中而被吸附於矽膠上，並用己烷/醋酸乙酯(4:1 to 3:1 v:v)沖洗出以得到一油脂。此油脂在用乙醚及己烷碾製下而結晶成一白色固体，此白色固体乾燥後得到6.2 g 步驟C之標題化合物，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (15)

一種本發明之化合物，熔於 72-76 °C。 ^1H NMR (CDCl_3 , 300 MHz) d 4.3-4.4 (m, 1 H), 4.4 (m, 1H), 5.5 (m, 1H), 6.85 (m, 1H), 7.0 (m, 2H), 7.4-7.7 (m, 9H)。

實施例 2

4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑之分離

4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑之工業樣品 (純度 95% 或更高) 以 10-15 mg/mL 溶解於己烷/異丙醇 (80/20) 中。所得之樣品溶液用己烷/異丙醇 (80/20) 作為流動相，在 (S,S)-Whelk-01 管柱上分離 (手性管柱來自 Regis, Pirkle-Concept 手性固定相衍生自 (S,S)-4-(3,5-二硝基苯甲醯胺)-四氫菲共價鍵結於 5 mm 矽膠)。分析式 (25 cm x 4.6 mm ID, Regis 目錄編號 786101) 及製備式 (25 cm x 10 mm ID, Regis 目錄編號 786102) 管柱兩者皆用於此，且將 500 mL 或更多的樣品溶液注射入各個管柱。約 10-20 mg 之各個左右對稱體在 8 小時內從每個管柱收集起來。(-)-4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑為第一個沖洗出的左右對稱體 (於分析式管柱上滯留時間 $t_R = 10$ 分鐘，當流速為 1 mL/min 且偵測器設定於波長 310nm)，而 (+)-4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑為第二個沖洗出的左右對稱體 (於分

(請先閱讀背面之注意事項再填)

裝

訂

線

五、發明說明 (16)

析式管柱上滯留時間 $t_R = 22$ 分鐘，當流速為 1 mL/min 且偵測器設定於波長 310 nm 。

(-)-4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑之樣品 俱有旋光度 $[\alpha]_D^{20} = -27.8^\circ \pm 0.9^\circ$ ($c \ 0.87$, CHCl_3)及熔點 $71-73^\circ \text{C}$ ，且一(+)-4-[4'[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑之樣品俱有旋光度 $[\alpha]_D^{20} = +27.2^\circ \pm 2.0^\circ$ ($c \ 0.99$, CHCl_3)及熔點 $77-78^\circ \text{C}$ 。

藉此處所提及之步驟，和此技藝中已知的方法，下列於表1至30中的化學式 I 之化合物可製備出來。表1中第1列之化合物可被稱作為 1-1、1-2、1-3、及1-4（以列及行來指定）。包含於這些表中之所有其它特定的化合物可以類似的方式來指定。以下為用在下表中的縮寫；
Me = 甲基，Et = 乙基，OMe = 甲氧基，及OEt = 乙氧基。

表 1

$R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = H, n = 0, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
1	CH_2F	CHCl_2	CHFCl_2	CF_2CFCI_2
2	CF_2H	CHClCF_3	$\text{CF}_2\text{CF}_2\text{H}$	CFCICF_3
3		CFCl_2	CFCICF_2Cl	CFBrCF_3
4	CF_2Cl	CHFCI	CCl_2CF_3	CH_2CF_3
5	CF_2Br	CFCIBr	CF_2CF_3	CF_2CH_3

五、發明說明 (17)

表 2

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = H, n = 1, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
6	CH ₂ F	CHCl ₂	CHF CF ₃	CF ₂ CFCl ₂
7	CF ₂ H	CHClCF ₃	CF ₂ CF ₂ H	CFCICF ₃
8	CF ₃	CFCI ₂	CFCICF ₂ Cl	CFBrCF ₃
9	CF ₂ Cl	CHFCI	CCl ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃
10	CF ₂ Br	CFCIBr	CF ₂ CF ₃	CF ₂ CH ₃

表 3

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = H, n = 2, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
11	CH ₂ F	CHCl ₂	CHF CF ₃	CF ₂ CFCl ₂
12	CF ₂ H	CHClCF ₃	CF ₂ CF ₂ H	CFCICF ₃
13	CF ₃	CFCI ₂	CFCICF ₂ Cl	CFBrCF ₃
14	CF ₂ Cl	CHFCI	CCl ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃
15	CF ₂ Br	CFCIBr	CF ₂ CF ₃	CF ₂ CH ₃

表 4

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = Me, n = 0, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
16	CH ₂ F	CHCl ₂	CHF CF ₃	CF ₂ CFCl ₂
17	CF ₂ H	CHClCF ₃	CF ₂ CF ₂ H	CFCICF ₃
18	CF ₃	CFCI ₂	CFCICF ₂ Cl	CFBrCF ₃
19	CF ₂ Cl	CHFCI	CCl ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃
20	CF ₂ Br	CFCIBr	CF ₂ CF ₃	CF ₂ CH ₃

(請先閱讀背面之注意事項再填本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (18)

表 5

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = Me, n = 1, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
21	CH ₂ F	CHCl ₂	CHFCF ₃	CF ₂ CFCI ₂
22	CF ₂ H	CHClCF ₃	CF ₂ CF ₂ H	CFCICF ₃
23	CF ₃	CFCI ₂	CFCICF ₂ Cl	CFBrCF ₃
24	CF ₂ Cl	CHFCI	CCl ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃
25	CF ₂ Br	CFCIBr	CF ₂ CF ₃	CF ₂ CH ₃

表 6

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = Me, n = 2, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
26	CH ₂ F	CHCl ₂	CHFCF ₃	CF ₂ CFCI ₂
27	CF ₂ H	CHClCF ₃	CF ₂ CF ₂ H	CFCICF ₃
28	CF ₃	CFCI ₂	CFCICF ₂ Cl	CFBrCF ₃
29	CF ₂ Cl	CHFCI	CCl ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃
30	CF ₂ Br	CFCIBr	CF ₂ CF ₃	CF ₂ CH ₃

表 7

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = Et, n = 0, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
31	CH ₂ F	CHCl ₂	CHFCF ₃	CF ₂ CFCI ₂
32	CF ₂ H	CHClCF ₃	CF ₂ CF ₂ H	CFCICF ₃
33	CF ₃	CFCI ₂	CFCICF ₂ Cl	CFBrCF ₃
34	CF ₂ Cl	CHFCI	CCl ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃
35	CF ₂ Br	CFCIBr	CF ₂ CF ₃	CF ₂ CH ₃

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (19)

表 8

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = Et, n = 1, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
36	CH ₂ F	CHCl ₂	CHF CF ₃	CF ₂ CFCl ₂
37	CF ₂ H	CHClCF ₃	CF ₂ CF ₂ H	CFCICF ₃
38	CF ₃	CFCI ₂	CFCICF ₂ Cl	CFBrCF ₃
39	CF ₂ Cl	CHFCI	CCl ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃
40	CF ₂ Br	CFCIBr	CF ₂ CF ₃	CF ₂ CH ₃

表 9

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = Et, n = 2, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
41	CH ₂ F	CHCl ₂	CHF CF ₃	CF ₂ CFCl ₂
42	CF ₂ H	CHClCF ₃	CF ₂ CF ₂ H	CFCICF ₃
43	CF ₃	CFCI ₂	CFCICF ₂ Cl	CFBrCF ₃
44	CF ₂ Cl	CHFCI	CCl ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃
45	CF ₂ Br	CFCIBr	CF ₂ CF ₃	CF ₂ CH ₃

表 10

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = OMe, n = 0, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
46	CH ₂ F	CHCl ₂	CHF CF ₃	CF ₂ CFCl ₂
47	CF ₂ H	CHClCF ₃	CF ₂ CF ₂ H	CFCICF ₃
48	CF ₃	CFCI ₂	CFCICF ₂ Cl	CFBrCF ₃
49	CF ₂ Cl	CHFCI	CCl ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃
50	CF ₂ Br	CFCIBr	CF ₂ CF ₃	CF ₂ CH ₃

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (20)

表 1 1

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = OMe, n = 1, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
51	CH_2F	$CHCl_2$	$CHFCF_3$	CF_2CFCl_2
52	CF_2H	$CHClCF_3$	CF_2CF_2H	$CFCICF_3$
53	CF_3	$CFCI_2$	$CFCICF_2Cl$	$CFBrCF_3$
54	CF_2Cl	$CHFCI$	CCl_2CF_3	CH_2CF_3
55	CF_2Br	$CFCIBr$	CF_2CF_3	CF_2CH_3

表 1 2

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = OMe, n = 2, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
56	CH_2F	$CHCl_2$	$CHFCF_3$	CF_2CFCl_2
57	CF_2H	$CHClCF_3$	CF_2CF_2H	$CFCICF_3$
58	CF_3	$CFCI_2$	$CFCICF_2Cl$	$CFBrCF_3$
59	CF_2Cl	$CHFCI$	CCl_2CF_3	CH_2CF_3
60	CF_2Br	$CFCIBr$	CF_2CF_3	CF_2CH_3

表 1 3

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = OEt, n = 0, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
61	CH_2F	$CHCl_2$	$CHFCF_3$	CF_2CFCl_2
62	CF_2H	$CHClCF_3$	CF_2CF_2H	$CFCICF_3$
63	CF_3	$CFCI_2$	$CFCICF_2Cl$	$CFBrCF_3$
64	CF_2Cl	$CHFCI$	CCl_2CF_3	CH_2CF_3
65	CF_2Br	$CFCIBr$	CF_2CF_3	CF_2CH_3

(請先閱讀背面之注意事項再填本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (21)

表 1 4

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = OEt, n = 1, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
66	CH_2F	$CHCl_2$	$CHFCF_3$	CF_2CFCI_2
67	CF_2H	$CHClCF_3$	CF_2CF_2H	$CFCICF_3$
68	CF_3	$CFCI_2$	$CFCICF_2Cl$	$CFBrCF_3$
69	CF_2Cl	$CHFCI$	CCl_2CF_3	CH_2CF_3
70	CF_2Br	$CFCIBr$	CF_2CF_3	CF_2CH_3

表 1 5

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = OEt, n = 2, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
71	CH_2F	$CHCl_2$	$CHFCF_3$	CF_2CFCI_2
72	CF_2H	$CHClCF_3$	CF_2CF_2H	$CFCICF_3$
73	CF_3	$CFCI_2$	$CFCICF_2Cl$	$CFBrCF_3$
74	CF_2Cl	$CHFCI$	CCl_2CF_3	CH_2CF_3
75	CF_2Br	$CFCIBr$	CF_2CF_3	CF_2CH_3

表 1 6

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = F, n = 0, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
76	CH_2F	$CHCl_2$	$CHFCF_3$	CF_2CFCI_2
77	CF_2H	$CHClCF_3$	CF_2CF_2H	$CFCICF_3$
78	CF_3	$CFCI_2$	$CFCICF_2Cl$	$CFBrCF_3$
79	CF_2Cl	$CHFCI$	CCl_2CF_3	CH_2CF_3
80	CF_2Br	$CFCIBr$	CF_2CF_3	CF_2CH_3

(請先閱讀背面之注意事項再填本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(22)

表 1 7

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = F, n = 1, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
81	CH ₂ F	CHCl ₂	CHF CF ₃	CF ₂ CFCl ₂
82	CF ₂ H	CHClCF ₃	CF ₂ CF ₂ H	CFCICF ₃
83	CF ₃	CFCI ₂	CFCICF ₂ Cl	CFBrCF ₃
84	CF ₂ Cl	CHFCI	CCl ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃
85	CF ₂ Br	CFCIBr	CF ₂ CF ₃	CF ₂ CH ₃

表 1 8

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = F, n = 2, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
86	CH ₂ F	CHCl ₂	CHF CF ₃	CF ₂ CFCl ₂
87	CF ₂ H	CHClCF ₃	CF ₂ CF ₂ H	CFCICF ₃
88	CF ₃	CFCI ₂	CFCICF ₂ Cl	CFBrCF ₃
89	CF ₂ Cl	CHFCI	CCl ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃
90	CF ₂ Br	CFCIBr	CF ₂ CF ₃	CF ₂ CH ₃

表 1 9

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = Cl, n = 0, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
91	CH ₂ F	CHCl ₂	CHF CF ₃	CF ₂ CFCl ₂
92	CF ₂ H	CHClCF ₃	CF ₂ CF ₂ H	CFCICF ₃
93	CF ₃	CFCI ₂	CFCICF ₂ Cl	CFBrCF ₃
94	CF ₂ Cl	CHFCI	CCl ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃
95	CF ₂ Br	CFCIBr	CF ₂ CF ₃	CF ₂ CH ₃

(請先閱讀背面之注意事項再填本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (23)

表 2 0

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = Cl, n = 1, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
96	CH_2F	$CHCl_2$	$CHF CF_3$	$CF_2 CF Cl_2$
97	CF_2H	$CHCl CF_3$	$CF_2 CF_2H$	$CFC Cl CF_3$
98	CF_3	$CFC l_2$	$CFC Cl CF_2 Cl$	$CF Br CF_3$
99	$CF_2 Cl$	$CHFC l$	$CCl_2 CF_3$	$CH_2 CF_3$
100	$CF_2 Br$	$CFC l Br$	$CF_2 CF_3$	$CF_2 CH_3$

表 2 1

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = Cl, n = 2, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
101	CH_2F	$CHCl_2$	$CHF CF_3$	$CF_2 CF Cl_2$
102	CF_2H	$CHCl CF_3$	$CF_2 CF_2H$	$CFC Cl CF_3$
103	CF_3	$CFC l_2$	$CFC Cl CF_2 Cl$	$CF Br CF_3$
104	$CF_2 Cl$	$CHFC l$	$CCl_2 CF_3$	$CH_2 CF_3$
105	$CF_2 Br$	$CFC l Br$	$CF_2 CF_3$	$CF_2 CH_3$

表 2 2

 $R^1 = H, R^2 = F, R^3 = H, R^5 = H, n = 0, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
106	CF_2H	$CF_2 Cl$	$CF_2 CF_2H$	$CHCl CF_3$
107		$CF_2 Br$	$CF_2 CF_3$	$CFC Cl CF_2 Cl$

(請先閱讀背面之注意事項再填本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (24)

表 2 3

 $R^1 = F, R^2 = Cl, R^3 = H, R^5 = H, n = 0, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
108	CF_2H	CF_2Cl	CF_2CF_2H	$CHClCF_3$
109		CF_2Br	CF_2CF_3	$CFCICF_2Cl$

表 2 4

 $R^1 = Cl, R^2 = Cl, R^3 = H, R^5 = H, n = 0, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
110	CF_2H	CF_2Cl	CF_2CF_2H	$CHClCF_3$
111	CF_3	CF_2Br	CF_2CF_3	$CFCICF_2Cl$

表 2 5

 $R^1 = H, R^2 = Cl, R^3 = H, R^5 = H, n = 0, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
112	CF_2H	CF_2Cl	CF_2CF_2H	$CHClCF_3$
113	CF_3	CF_2Br	CF_2CF_3	$CFCICF_2Cl$

表 2 6

 $R^1 = F, R^2 = F, R^3 = F, R^5 = H, n = 0, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
114	CF_2H	CF_2Cl	CF_2CF_2H	$CHClCF_3$
115	CF_3	CF_2Br	CF_2CF_3	$CFCICF_2Cl$

(請先閱讀背面之注意事項再填本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (25)

表 2 7

 $R^1 = H, R^2 = F, R^3 = F, R^5 = H, n = 0, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
116	CF_2H	CF_2Cl	CF_2CF_2H	$CHClCF_3$
117	CF_3	CF_2Br	CF_2CF_3	$CFCICF_2Cl$

表 2 8

 $R^1 = F, R^2 = Cl, R^3 = F, R^5 = H, n = 0, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
118	CF_2H	CF_2Cl	CF_2CF_2H	$CHClCF_3$
119	CF_3	CF_2Br	CF_2CF_3	$CFCICF_2Cl$

表 2 9

 $R^1 = Cl, R^2 = Cl, R^3 = F, R^5 = H, n = 0, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
120	CF_2H	CF_2Cl	CF_2CF_2H	$CHClCF_3$
121	CF_3	CF_2Br	CF_2CF_3	$CFCICF_2Cl$

表 3 0

 $R^1 = H, R^2 = Cl, R^3 = F, R^5 = H, n = 0, R^4 =$

	第1列	第2列	第3列	第4列
122	CF_2H	CF_2Cl	CF_2CF_2H	$CHClCF_3$
123	CF_3	CF_2Br	CF_2CF_3	$CFCICF_2Cl$

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (26)

表 3 1

124 (-)-4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-
 醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑

125 (-)-4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-
 醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑之亞-
 碲，其中此亞碲具有 S 構形

126 (-)-4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-
 醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑之-亞
 碲，其中此亞碲具有 R 構形

127 (-)-4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-
 醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑之-碲

配方 / 應用

本發明之化合物將大致上與一農業上適當的，由至少一種液態稀釋劑、固態稀釋劑或界面活性劑構成之載體，用作一配方或組成。此配方或組成成份須選活性成份之物性、施用型態及環境因子像土壤型態、濕度及溫度穩定。可用之配方包括液体，像溶液(包括乳化濃縮質)、懸浮液、乳劑(包括微乳劑(microemulsions)及/或懸浮乳劑(suspoemulsions))及其或可增稠成膠狀的類似物質。更多可用之配方包括固体，像微塵、粉末、顆粒、球粒、錠粒、薄膜，及可擴散於水的類似物質("可濕性")或水

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (27)

溶性。 活性成份可被(微)膠囊包裹及進一步成型為一懸浮液 或固態配方；另一方面，此整體活性成份配方可被膠囊包裹（或"由外面包住"）。 膠囊包裹法可控制或延遲此活性成份之釋出。可噴撒的配方可延用於適當的介質裡，且用在噴撒容量每公畝從一公升至數百公升。高強度組成物主要用作進一步配方之中間產物。

此配方通常含有一有效份量之活性成份、稀釋劑及界面活性劑於下列大概範圍內之，其相加成為重量百分比100。

	重 量 百 分 比		
	活 性 成 份	稀 釋 劑	界 面 活 性 劑
水分散性及水溶性顆粒、 錠粒及粉末。	5-90	0-94	1-15
懸浮液、乳劑、溶液(包 括乳化濃縮質)	5-50	40-95	0-15
微塵	1-25	70-99	0-5
顆粒及球粒	0.01-99	5-99.99	0-15
高強度組成物	90-99	0-10	0-2

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

—線

五、發明說明 (28)

典型的固態稀釋劑在 Watkins, et al., Handbook of Insecticide Dust diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey 中有描述。典型的液態稀釋劑在 Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950. McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, Allured Publ. Corp., Ridgewood, New Jersey, 以及 Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964 中有描述，列舉界面活性劑及建議用法。所有配方可包含少量添加物以減少起泡、結塊、腐蝕、微生物生長及類似情形，或加增稠劑以增加粘稠度。

界面活性劑包括了，例如，聚乙氧化醇類化合物、聚乙氧化烷基酚類化合物、聚乙氧化脫水山梨醇脂酸酯、二烷基磺基琥珀酸鹽類、烷基硫酸鹽、烷基苯磺酸鹽、有機矽化合物、N,N-二烷基牛膽磺酸鹽類、木質素磺酸鹽、奈磺酸、甲醛濃縮物、聚羧酸鹽、及聚氧乙烯/聚氧丙烯成塊共聚物。固態稀釋劑包括，例如，黏土像膠質黏土、蒙脫石、矽鎂土及高嶺土、澱粉、糖、矽膠、滑石、矽藻土、尿素、碳酸鈣、碳酸鈉及碳酸氫鹽，及硫酸鈉。液態稀釋劑包括，例如，水、N,N-二甲基甲醯胺、二甲基亞碸、N-烷基一氮五圓酮、乙二醇、聚丙二醇、石蠟、烷苯、烷基奈、橄欖油、海狸油、亞麻仁油、桐油、芝麻油、玉米油、花生油、棉籽油、大豆油、油菜籽油及椰子油。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

—線

五、發明說明 (29)

，脂酸酯、酮類像環己酮、2-庚酮、異佛樂酮及4-氫氧-4-甲基-2-戊酮，及醇類像甲醇、環己醇、癸醇及四氫呋喃甲醇。

溶液，包括乳化濃縮質，只要藉混合各成份就能製備。微塵及粉末可藉混合及研磨於一般的鏈式磨粉機或流能磨來製備。懸浮液一般藉濕磨法來製備；見，例如，U. S. 3,060,084。顆粒及球粒可藉噴撒此活性物質於事先成型的顆粒載體，或藉相類似的技術來製備。見 Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57及following, 及WO 91/13546。球粒可如 U. S. 4,172,714中所述來製備。水分散性及水溶性顆粒可如 U. S. 4,144,050、U. S. 3,920,442及 DE 3,246,493中所指導的來製備。錠粒可如 U. S. 5,180,587、U. S. 5,232,701及 U. S. 5,208,030中所指導的來製備。薄膜可如 GB 2,095,558及 U. S. 3,299,566 中所指導的來製備。

進一步有關此配方的技藝的資料，見 U. S. 3,235,361, Col. 6, line 16 至 Col. 7, line 19及實施例 10-41; U. S. 3,309,192, Col. 5, line 43 至 Col. 7, line 62及實施例 8、12、15、39、41、52、53、58、132、138-140、162-164、166、167及169-182; U. S. 2,891,855, Col. 3, line 66 至 Col. 5, line 17及實施例 1-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (30)

4: Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley
及 Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96; 及 Hance et
al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell
Scientific Publications, Oxford, 1989。

在下列實施例中，所有百分比為重量百分比，且所有
配方為用傳統方式製備。化合物編號參照化合物索引表 A
-B。

實施例 A可濕性粉劑

化合物 2	65.0 %
十二酚聚乙二醇醚	2.0 %
木質素磺酸鈉	4.0 %
矽鋁酸鈉	6.0 %
蒙脫石 (鍛燒過)	23.0 %

實施例 B顆粒

化合物 2	10.0 %
矽鎂土 顆粒 (低揮發性的物質， 0.71/0.30 mm; U.S.S. No. 25-50 篩網)	90.0 %

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (31)

實施例 C擠出成型球粒

化合物 2	25.0 %
無水硫酸鈉	10.0 %
粗木質素磷酸鈣	5.0 %
烷基奈磷酸鈉	1.0 %
鈣 / 鎂膠質黏土	59.0 %

實施例 D乳化濃縮質

化合物 2	20.0 %
油溶性磷酸鹽及聚氧乙醚之混合	10.0 %
異佛樂酮	70.0 %

本發明之化合物俱有對抗廣泛之葉食性、吃果實的、莖或根食性、吃種子的、水生及土壤寄居性節肢動物之活性 ("節肢動物"一詞包括昆蟲、蟎類及線蟲類)，這些節肢動物為生長及儲存之農業作物、林業、溫室作物、裝飾植物、苗圃作物、儲存食物及纖維製品、畜牧業、家庭及公共場合，及動物保健的害蟲。熟於此技藝之人仕將承認一點即並非所有化合物對所有害蟲之所有生長階段皆為同樣有效。但是，所有本發明之化合物顯示其活性對抗害蟲包括：鱗翅目的卵、幼蟲及成蟲；鞘翅目的卵，葉食性、吃果實的、莖或根食性、吃種子的幼蟲及成蟲；半翅

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (32)

目及同翅目的卵、幼蟲及成蟲；蜱蟎目的卵、幼蟲、蛹及成蟲；縷翅目、直翅目及革翅目的卵、幼蟲及成蟲；雙翅目的卵、幼蟲及成蟲；及線蟲門的卵、幼蟲及成蟲。本發明之化合物亦有效對抗膜翅目、等翅目、蝨目、蜚蠊目、縷尾目及嚙蟲目的害蟲；屬於蜘蛛綱及扁蟲門的害蟲。更明確地，該化合物有效地對抗南方玉米根蟲(*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、星狀葉蟬(*Mascrosteles fascifrons*)、棉象蟲(*Anthonomus grandis*)、二點紅蜘蛛(*Tetranychus urticae*)、秋黏蟲(*Spodoptera frugiperda*)、黑豆蚜蟲(*Aphis fabae*)、桃蚜(*Myzus persica*)、棉蚜(*Aphis gossyp*)、俄羅斯小麥蚜蟲(*Diuraphis noxia*)、英國穀蚜(*Sitobion avenae*)、煙草夜蛾幼蟲(*Heliothis virescens*)、米象(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、稻葉泥蟲(*Oulema oryzae*)、白背光蟬(*Sogatella furcifera*)、青葉蟬(*Nephotettix cincticeps*)、棕色光蟬(*Nilaparvata lugens*)、小棕色光蟬(*Laodelphax striatellus*)、水稻二化螟(*Chilo suppressalis*)、稻縱捲葉蟲(*Cnaphalocrocis medinalis*)、黑稻臭蟲(*Scotinophara lurida*)、稻臭蟲(*Oebalus pugnax*)、稻蛛緣蝽(*Leptocoris chinensis*)、針緣蝽(*Cletus puntiger*)、及南方綠臭蟲(*Nezara viridula*)。此化合物對蟎類有活性，對抗像葉蟎科證實有殺卵、殺幼蟲及化學絕育劑活性，包括 *Tetranychus urticae*、*Tetranychus cinnabarinus*、*Tetranychus rncdanieli*、

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

—線

五、發明說明 (33)

Tetranychus pacificus、Tetranychus turkestanii、
 Byrobia rubrioculus、Panonychus ulmi、Panonychus
 citri、Eotetranychus carpini borealis、
 Eotetranychus hicoriae、Eotetranychus
 sexmaculatus、Eotetranychus yumensis、
 Eotetranychus banksi及Oligonychus pratensis：細鬚
 蟎科包括 Brevipalpus lewisi、Brevipalpus
 phoenicis、Brevipalpus californicus及 Brevipalpus
 obovatus；瘿蟎科包括 Phyllocoptruta oleivora、
 Eriophyes sheldoni、Aculus cornutus、Epitrimerus
 pyri及Eriophyes mangiferae。更多詳細的害蟲敘述，見
 WO 90/10623及WO 92/00673。

本發明之化合物亦可與一或多個其它殺蟲劑、除霉劑
 、殺線蟲劑、殺菌劑、殺蟎劑、生長調節劑、化學絕育劑
 、化學信息素、驅蟲劑、誘蟲劑、費洛蒙、促食劑 (
 feeding stimulants)，或其它生物上之活性化合物混合
 以形成一多重組成份殺蟲劑，如此得到更廣泛範圍的農業
 保護劑。此類含本發明化合物之農業保護劑之實施例的配
 方可以是：殺蟲劑、殺線蟲劑及殺蟎劑 像巴每停 (
 abamectin)、殺蟲靈、阿苦那斯 (acrinathrin)、尼卡 (
 alanycarb)、涕天威、多西卡 (aldoxycarb)、阿法美斯 (
 alphamethrin)、滿抓 (amitraz)、福美停 (avermectin)、
 茚苦棟子素、保棉磷、偶氮環錫 (azocyclotin)、惡蟲威
 、苯福卡 (benfuracarb)、苯掃 (bensultap)、賽福磷 (

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

一線

五、發明說明 (34)

betacyfluthrin)、百酚磷(bifenthrin)、BPMC、博酚捕(brofenprox)、溴磷、布酚卡(bufencarb)、捕繁銑(buprofezin)、甲硫基丁酮甲氨基羰基肟、卡度殺(cadusafos)、甲氨基甲酸奈酯、虫蟊威、三硫磷、卡殺酚(carbosulfan)、巴丹、滅蟊猛、可索卡(chloethocarb)、可綠絲佛(chlorethoxyfos)、毒蟲畏、可酚排(chlorfenapyr) (AC303630)、(E)-N-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-N'-氰基-N-甲基-乙醯亞胺醯胺(ethanimidamide) (NI-25)、可服蛛隆(chlorfluazuron)、氯甲磷、乙酯殺蟊醇、毒死蜱、毒死蜱-甲基、可芬青(clofentezine)、殺螟睛、環普迅(cycloprothrin)、賽福春(cyfluthrin)、beta-賽福春(cyfluthrin)、哈羅春(cyhalothrin)、環己錫、賽美青(cypermethrin)、賽滿清(cyromazin)、德塔滿清(deltamethrin)、地滅通M、地滅通S、代芬敵隆(diafenthiuron)、地亞農、除線磷、敵敵畏、百治磷、乙硫磷、代本絲榮(diflubenzuron)、代慢殺(dimethoate)、二甲基烯磷(dimethylvinphos)、敵殺磷、乙拌磷、克瘟散、蟊每停(emamectin)、芬發(esfenvalerate)、殺虫丹、乙硫磷、索芬坡(ethofenprox)、殺螟松、翠坡(etrimphos)、芬巴青(fenpropathrin)、芬那米佛(fenamiphos)、芬那殺(fenazaquin)、六苯丁錫氧、芬消松(fenitrothion)、芬布卡(fenobucarb)、芬索卡(fenothiocarb)、芬賽卡(fenoxycarb)、芬巴青(fenpropathrin)、芬多西美(fenpyroximate)、倍硫磷、

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

一線

五、發明說明 (35)

芬樂瑞(fenvalerate)、飛普尼(fipronil)、佛西南(fluazinam)、佛樹榮(fluazuron) (CGA 157419)、佛賽克榮(flucycloxuron)、弗賽瑞(flucythrinate)、弗芬絲榮(flufenoxuron)、綠芬坡(flufenprox)、道綠發瑞(tau-fluvalinate)、地虫磷、安果、弗西類(fosthiazate)、發芬坡(fubfenprox)、夫拉西卡(furathiocarb)、HCH、黑諾佛(heptenophos)、殺福猛(hexaflumuron)、西亞索(hexythiazox)、咪寇皮(imidacloprid)、衣波班佛(iprobenfos)、衣作佛(isazophos)、埃索酚弗(isofenphos)、埃索坡(isoprocarb)、異惡唑磷、愛梅庭(ivermectin)、lambda-哈羅春(cyhalothrin)、路芬榮(lufenuron) (CGA 184669)、馬拉松、滅蚜磷、美蘇芬(mesulfenfos)、多聚乙醛、美殺快(methacrifos)、美薩咪多(methamidophos)、殺撲磷、滅虫威、滅多虫、美多卡(metolcarb)、莎坪(methoprene)、甲氧滴滴涕、甲基7-氯-2,5-二氫-2-[[(甲氧基羰基) [4-(三氟甲氧基) 苯基] 氨基) 羰基] 茚并[1,2-e] [1,3,4] 氧二氮三烯六圓(oxadiazine)-4a-羧酸鹽(DPX- JW062)、密倍庭(milbemectin)、久效磷、莫賽庭(moxidectin)、氧樂果、草氫鹽、磯吸磷、奧西迪坡(oxydeprofos)、對硫磷、對硫磷-甲基、苄氯菊酯、稻豐散、甲拌磷、伏殺磷、弗司麥(phosmet)、福發美冬(phosphamidon)、辛硫磷、抗蚜威、甲基虫蠟磷、乙基虫蠟磷、坡芬佛(profenofos)、猛殺威、丙虫磷、克蠟特、殘殺威、坡西佛斯(prothiofos)

(請先閱讀背面之注意事項再填本頁)

裝

訂

—線

五、發明說明 (36)

、發果、派美佐新(pymetrozine)、派瑞寇(pyraclofos)
 、披達本(pyridaben)、皮瑞春(pyresmethrin)、除虫菊
 、披美地芬(pyrimidifen)、披西芬(pyriproxyfen)、皮
 美新(pymetrozine)、奎硫磷、雷米欣(remethrin)、魚藤
 酮、殺抗松、希布佛(sebuphos)、西拉弗芬(silafluofen)
)、賓諾沙(spinosad)、莎弗苔(sulfotep)、莎坡弗斯(
 sulprofos)、特布芬諾塞(tebufenozide) (RH 5992)、特
 布芬派瑞(tebufenpyrad)、太布披里弗(tebupirimphos)
 、天福苯榮(teflubenzuron)、天福欣(tefluthrin)、硫
 甲雙磷、特班(terbam)、特比弗斯(terbufos)、殺虫畏、
 西凡諾(thiofanox)、西代卡(thiodicarb)、西美松(
 thiomethon)、治線磷、多羅美欣(tralomethrin)、三阿
 樂幸(triarathene)、三唑磷、敵百虫、三福木隆(
 triflumuron)、三美它卡(trimethacarb)、蚜滅多、XMC
 、殺力卡(xylylcarb)及zeta-賽普美欣(cypermethrin)；
 殺真菌劑像阿敵沫(alldimorph)、安普皮福斯(
 ampropylfos)、防黴靈、雜空那唑(azaconazole)、阿左
 西挫并(azoxystrobin) (ICIA5504)、奔那西爾(
 benalaxyl)、麥銹靈、苯菌靈、樂殺蟎、聯苯、必丹醇(
 bitertanol)、滅瘟素、波爾多液(三鹼價的硫酸銅)、伯
 謬空那唑(bromuconazole)、捕疋美(bupirimate)、捕效
 備(buthiobate)、卡塔福(captafol)、克菌丹、卡苯達金
 (carbendazim)、萎銹靈、滅蟎猛、地茂散、氯化苦、百
 菌清、寇佐靈(chlozolinate)、氧鹽酸銅、銅鹽、硫雜靈

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

—線

五、發明說明 (37)

、環己烯、西莫殺尼(cymoxanil)、賽普空那唑(cyproconazole)、賽普敵尼(cyprodinil)(CGA 219417)、賽普福藍(cyprofuram)、雙氯酚、代寇不錯(diclobutrazol)、代寇輔耐(diclofluanide)、代寇美津(diclomezine)、氯硝胺、開樂散、敵諾寇(dienochlor)、代索芬卡(diethofencarb)、代芬空那唑(difenoconazole)、代美西利莫(dimethirimol)、代美索莫(dimethomorph)、代乃空那唑(diniconazole)、代乃空那唑-M(diniconazole-M)、代諾克(dinocap)、二苯基胺、代疋散(dipyrrithione)、敵妥靈福(ditalimfos)、代賽棕(dithiazon)、多果定、敵菌酮、克瘟散、乙氧空那唑(epoxyconazole)(BAS 480F)、乙菌定、乙去大唑(etr Diazole)、芬那里莫(fenarimol)、芬不空那唑(fenbuconazole)、甲基苯基夫喃羧鹽胺、芬尼挫拚(fenitropan)、芬疋孔尼(fenpiclonil)、芬普披定(fenpropidin)、芬普疋莫(fenpropimorph)、薯瘟錫、薯瘟錫氫氧化物(fentin hydroxide)、福美鐵、費林棕(ferimzone)、福己南(fluzinam)、福敵索尼(fludioxonil)、氟樂邁(fluoromide)、福青空那唑(fluquinconazole)、福西拉唑(flusilazole)、氟殺邁(flusulfamide)、福托拉尼(flutolanil)、福再福(flutriafol)、滅菌丹、福提鋁(fosetyl-aluminum)、福里達唑(fuberidazol)、福拉西爾(furalaxyl)、福美環氧(furmecyclox)、雙胍鹽、六氯苯唑(hexachlorobenzole

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (38)

)、六空那唑(hexaconazole)、海美殺唑(hymexazol)、依
 瑪雜里(imazalil)、依米苯空那唑(imibenconazole)、亞
 胺辛啉(iminoctadine)、異普空那唑(ipconazole)、艾普
 苯佛(iprobenfos)、二氯苯基甲乙基二氧咪唑烷鹽胺、富
 士一號、春日黴素、克索新(kresoxim)-甲基(BAS 490F)
 、猛銅(mancopper)、猛寇蟹(mancozeb)、代森錳、美杞
 尼足靈(mepanipyrim)、美普尼(mepronil)、美塔拉西(
 metalaxyl)、美空那唑(metconazole)、美殺福卡(
 methasulfocarb)、三甲基苯基呋喃羧酸胺、(E)-2-(甲氧
 亞胺基)-N-甲基-2-(2-苯氧苯基)acetamidemetiram (SSF
 -126)、美撒佛克(metsulfovax)、邁寇不塔尼(
 myclobutanil)、甲肫鐵鉍(鐵甲烷砷酸鐵)、耐挫索(
 nitrothal)-異丙基、鬧里莫(nuarimol)、歐福瑞(
 ofurace)、歐撒敵西(oxadixyl)、歐西卡伯新(
 oxycarboxin)、佩福拉贊(pefurazoate)、片空那唑(
 penconazole)、片西枯隆(pencycuron)、福斯敵芬(
 phosdiphen)、苯酞、匹馬菌素、粉病靈、聚氨基甲酸酯
 、多氧菌素、賽菌靈、普寇拉(prochloraz)、普西密東(
 procymidone)、普潘莫卡(propamocarb)、普皮空那唑(
 propiconazole)、甲基代森鋅、定菌磷、疋里芬諾(
 pyrifenox)、疋里滅殺尼(pyrimethanil)、疋若奎隆(
 pyroquilon)、五氯硝基苯、硫、特不空那唑(
 tebuconazole)、特寇塔藍(tecloftalame)、四氯硝基苯
 、四空那唑(tetraconazole)、涕必靈、賽修芬(

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

—線

五、發明說明 (39)

thicyofen)、苯硫尿酯-甲基、福美雙、脫寇福斯(tolclophos)-甲基、脫里福耐(tolyfluanid)、三敵美風(triadimefon)、氯苯氧基二甲乙基三唑、疊氮氧化物(triazoxide)、三氯醯胺(trichlamide)、三環吡咯(tricyclazole)、克啉菌、三氟米佐(triflumizol)、噻氮靈、三提空那唑(triticonazole)、單空那唑(uniconazole)、有效黴素、寇佐林(vinclozolin)、代森鋅、及福美鋅；殺菌劑像鏈黴素；及生物劑像Bacillus thuringiensis、Bacillus thuringiensis delta 內毒素、桿狀病毒(baculovirus)、及昆蟲傳染性細菌、病毒及真菌。

在特定情形下，與其它俱有類似範圍之控制不同作用型態之殺節肢動物劑之組合，會特別有利於抑制之處理。

較佳的本發明化合物之混合物，有較好害蟲控制(用量或範圍)或抑制處理者為結合殺節肢動物劑選自巴每停(abamectin)、芬巴青(fenpropathrin)、飛普尼(fipronil)、咪寇皮(imidacloprid)、滅多蟲、克蟬特、披達本(pyridaben)、特布芬諾塞(tebufenozide)及特布芬派瑞(tebufenpyrad)之中。特別好的混合物(化合物編號參照索引表A-B中之化合物)為選自：化合物2及巴每停(abamectin)；化合物2及芬巴青(fenpropathrin)；化合物2及飛普尼(fipronil)；化合物2及咪寇皮(imidacloprid)；化合物2及滅多蟲；化合物2及克蟬特；化合物2及披達本(pyridaben)；化合物2及特布芬諾塞

(請先閱讀背面之注意事項再填寫)

裝

訂

線

五、發明說明 (40)

(tebufenozide)；化合物 2及tebufenpyrad；化合物 3及巴每停(abamectin)；化合物 3及芬巴青(fenpropathrin)；化合物 3及飛普尼(fipronil)；化合物 3及咪寇皮(imidacloprid)；化合物 3及滅多蟲；化合物 3及克蠟特；化合物 3及披達本(pyridaben)；化合物 3及特布芬諾塞(tebufenozide)；化合物 3及tebufenpyrad；化合物 4及巴每停(abamectin)；化合物 4及芬巴青(fenpropathrin)；化合物 4及飛普尼(fipronil)；化合物 4及咪寇皮(imidacloprid)；化合物 4及滅多蟲；化合物 4及克蠟特；化合物 4及披達本(pyridaben)；化合物 4及特布芬諾塞(tebufenozide)；及化合物 4及特布芬派瑞(tebufenpyrad)之中。

控制節肢動物害蟲及農藝上、園藝上及特殊作物、動物及人的健康之保護，是藉使用一或多種此發明之化合物，以一有效份量，施於害蟲之環境來達成，包括農業經營及/或非農業經營的出沒之所在地，至要被保護的區域，或直接加在害蟲上來控制。因此，本發明包含了一控制葉及土壤寄生的節肢動物及線蟲類害蟲，及保護農業經營及或非農業經營之作物之方法，包括使用一或多種此發明化合物，或組成物包含至少一種此化合物，以一有效份量施用於害蟲之環境，包括其農業經營及/或非農業經營的出沒之所在地，至要被保護的區域，或直接加在害蟲上來控制。較佳的使用方法是噴灑。另一方面，這些化合物的顆粒配方可被用在植物葉片或土壤中。其他施用方

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (41)

法包括直接及後效性噴灑、空氣噴灑、覆種、微膠囊化、組織吸收、誘餌、耳標、填塞物、煙霧、薰蒸劑、噴霧器、微塵及很多其他形式。此化合物可摻入為節肢動物所食之誘餌，或裝置像陷阱及類似物。本發明之化合物可以其單純狀態使用，但最常應用的是包含一或多種化合物與適當的載體、稀釋劑、及界面活性劑之配方且可能與食物共同結合，依照預期最終用法而定。較佳使用法包括了噴灑此化合物之水分散液或純化的油溶液。與噴灑油、噴灑油濃縮劑、可塗抹的黏劑、補助劑、其他溶劑，及協同增效劑像 3,4-次甲基二氧苯丁氧化物混合通常會增強化合物的效果。

所需之有效控制使用量會依照這些因素像欲控制之節肢動物的種類、害蟲的生命週期、生命階段、它的大小、地點、一年內的時間、寄主作物或動物、攝食行為、交配行為、周圍的溼度、溫度、及類似者而定。在正常的情況下，每公畝約 0.01 至 2 kg 活性成份之施用量足以在農業經營的生態系統中控制害蟲，但小到 0.0001 kg/公頃可能已足夠或必須大到 8 kg/公頃才夠。在非農業經營的應用上，有效用量範圍約從 1.0 到 50 mg/平方公尺不等，但小到 0.1 mg/平方公尺可能已足夠或必須大到 150 mg/平方公尺才夠。

下列試驗證實本發明之化合物對特定害蟲的控制有效程度。"控制有效度"代表抑制節肢動物之發育(包括死亡)而造成攝食顯著減少的情形。然而，由此化合物產

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (42)

生害蟲控制之保護並不僅限於這些種類。見索引表 A-B 之化合物敘述。以下為用在下表中的縮寫：Me = 甲基，Et = 乙基，OMe = 甲氧基，及 OEt = 乙氧基。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

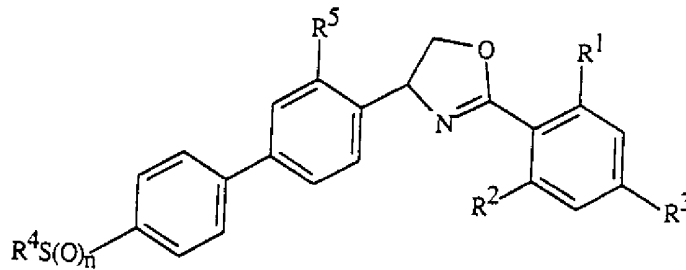
裝

訂

線

五、發明說明 (43)

索引表 A



化合物號碼	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	n	熔點(°C)
1	F	F	H	CH ₂ F	H	0	107-109
2 (Ex. 1)	F	F	H	CF ₂ H	H	0	72-76
3	F	F	H	CF ₂ H	H	1	71-72
4	F	F	H	CF ₂ H	H	2	115-117
5	F	F	H	CH ₂ F	H	1	固體*
6	F	F	H	CH ₂ F	H	2	固體*
7	F	F	H	CF ₂ H	OE _t	0	油*
8	F	F	H	CF ₂ H	OMe	0	油*
9	F	F	H	CH ₂ CF ₃	H	0	固體*
10	F	F	H	CF ₂ Br	H	0	100-102
11	F	F	H	CFCICF ₂ Cl	H	0	90-92.5
12	F	F	H	CF ₂ Cl	H	0	固體*
13	F	F	H	CF ₂ CF ₃	H	0	101-104
14	F	F	H	CF ₂ H	Me	0	油*
15	F	F	H	CF ₃	Me	0	固體*
16	Cl	H	H	CF ₂ H	H	0	59-62
17	F	H	H	CF ₂ H	H	0	70-76
18	Cl	Cl	H	CF ₂ H	H	0	96-100
19	Cl	F	H	CF ₂ H	H	0	油*
20	Cl	H	H	CF ₂ H	H	1	膠*
21	Cl	H	H	CF ₂ H	H	2	固體*
22 (+)	F	F	H	CF ₂ H	H	0	77-78
異構物							
23 (-)	F	F	H	CF ₂ H	H	0	71-73
異構物							

*¹H NMR數據參見索引表B

五、發明說明 (44)

索引表B

化合物號碼

¹H NMR數據(CDCl₃ 溶液除非另外指明)^a

5	δ 4.4 (m,1H), 4.8-4.9 (m,1H), 5.1-5.3 (m,2H), 5.5-5.6 (m,1H), 7.0 (m,2H), 7.4-7.5 (m,3H), 7.6 (m,2H), 7.7-7.8 (m,4H).
6	δ 4.3-4.4 (m,1H), 4.9 (m,1H), 5.1-5.3 (m,2H), 5.5-5.6 (m,1H), 7.0 (m,2H), 7.4-7.5 (m,3H), 7.6 (m,2H), 7.8 (m,2H), 8.0 (m,2H).
7	δ 1.4-1.5 (t,3H), 4.1-4.2 (q,2H), 4.2 (m,1H), 4.9 (m,1H), 5.7-5.8 (m,1H), 6.85 (t,1H), 7.0-7.1 (m,3H), 7.2 (m,1H), 7.4 (m,1H), 7.5 (m,1H), 7.6-7.7 (m,4H).
8	δ 3.9 (s,3H), 4.2 (m,1H), 4.9 (m,1H), 5.7 (m,1H), 6.85 (t,1H), 7.0-7.1 (m,3H), 7.2 (m,1H), 7.4 (m,1H), 7.5 (m,1H), 7.6-7.7 (m,4H).
9	δ 3.4-3.5 (m,2H), 4.3 (m,1H), 4.8 (m,1H), 5.5 (m,1H), 7.0 (m,2H), 7.2-7.6 (m,9H).
12	δ 4.3-4.4 (m,1H), 4.8-4.9 (m,1H), 5.5 (m,1H), 7.0 (m,2H), 7.4-7.5 (m,3H), 7.6-7.8 (m,6H).
14	δ 2.4 (s,3H), 4.2 (m,1H), 4.9 (m,1H), 5.7 (m,1H), 6.85 (t,1H), 7.0 (m,2H), 7.4-7.6 (m,4H), 7.6-7.7 (m,4H).
15	δ 2.4 (s,3H), 4.2 (m,1H), 4.9 (m,1H), 5.7 (m,1H), 7.0 (m,2H), 7.4-7.5 (m,4H), 7.6-7.7 (m,2H), 7.7 (m,2H).
19	δ 4.4 (m,1H), 4.9 (m,1H), 5.6 (m,1H), 6.86 (t,1H), 7.1 (m,1H), 7.3 (m,1H), 7.4 (m,1H), 7.4-7.5 (m,2H), 7.6-7.7 (m,6H).
20	δ 4.3-4.4 (m,1H), 4.8-4.9 (m,1H), 5.5 (m,1H), 6.1 (t,1H), 7.3-7.4 (m,1H), 7.4 (m,1H), 7.5 (m,3H), 7.6 (m,2H), 7.8 (m,4H), 7.9 (m,1H).
21	δ 4.3 (m,1H), 4.9 (m,1H), 5.5 (m,1H), 6.2 (t,1H), 7.3 (m,1H), 7.4 (m,1H), 7.5 (m,3H), 7.6-7.7 (m,2H), 7.8-7.9 (m,3H), 8.0-8.1 (m,2H).

^a ¹H NMR數據係在四甲基甲矽烷低磁場以ppm表示，耦合
係以(s)-單一譜線，(t)-三重譜線，(q)-四重譜線，
(m)-多重譜線表示。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(45)

本發明之生物實施例試驗 A二點紅蜘蛛 (Tetranychus urticae) 之幼蟲

試驗化合物溶液藉溶解於一最少量的丙酮並加入包含濕劑的水來製備，直到該化合物濃度為 50 ppm。被二點紅蜘蛛的卵佈滿之兩週大的紅芸豆植株，以此試驗溶液用一台可旋轉的灑水器噴灑至溢出(相當於 28 g/ha)。植株保存於 25°C 及 50 % 相對溼度的箱子裡。噴灑後七天，試驗化合物中，下列組得到 80 % 或更高的殺幼蟲/殺卵活性：1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9*, 10*, 11*, 12**, 13*, 14*, 15*, 16**, 17**, 18**, 19* 及 23**。

* 化合物噴撒的濃度為 5 ppm (相當於 2.8 g/ha)。

** 化合物噴撒的濃度為 0.5 ppm (相當於 0.28 g/ha)。

試驗 B秋黏蟲整植株測試

試驗化合物溶液藉溶解於一最少量的丙酮並加入包含濕劑的水來製備，直到此化合物濃度為 10 ppm。然後將試驗化合物以在地上溢流(相當於 5.5 g/ha)噴撒於大豆植株上，使用一旋轉台及自動灑水器。將處理過的植株乾燥，且使秋黏蟲(*Spodoptera frugiperda*) 幼蟲接觸到試驗的、處理過的葉片。試驗組保持於 27°C 及 50 % 相對溼度，並於出沒 120 小時後(post-infestation)評估幼蟲死亡率。試驗化合物中，下列組得到死亡率 80% 或更

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (46)

高的層級： 2*, 3*, 4*, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12**, 13, 14, 15**, 16*, 17*, 18*, 19及 23**。

* 化合物 噴撒的濃度為 3 ppm (相當於 1.6 g/ha)。

** 化合物 噴撒的濃度為 0.3 ppm (相當於 0.16 g/ha)

。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

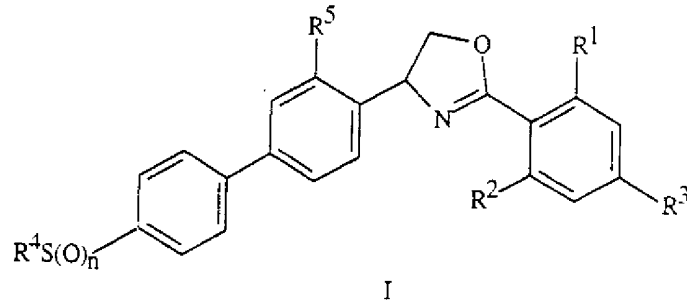
訂

線

四、中文發明摘要 (發明之名稱：

噁唑啉殺節肢動物劑

化學式 I 的化合物，及它們在農業上適用之鹽類，被發表為有用的殺節肢動物劑，



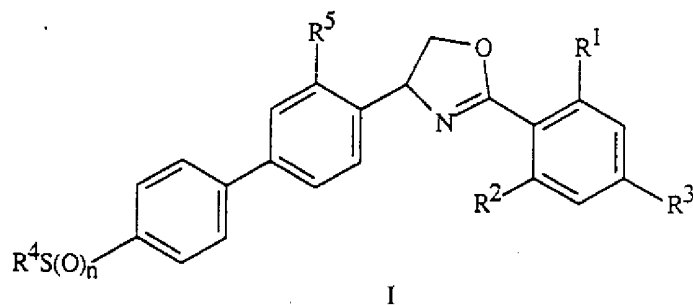
其中 R^1-R^5 及 n 如本發表中之定義。

同時發表的有包含此化學式 I 化合物之組成物，及一種控制節肢動物的方法，其包括以一有效份量之化學式 I 的化合物觸及此節肢動物或它們的生長環境。

英文發明摘要 (發明之名稱：

OXAZOLINE ARTHROPODICIDES
ABSTRACT OF THE DISCLOSURE

Compounds of Formula I, and their agriculturally-suitable salts, are disclosed which are useful as arthropodicides



wherein R^1-R^5 and n are as defined in the disclosure.

Also disclosed are compositions containing the compounds of Formula I and a method for controlling arthropods which involves contacting the arthropods or their environment with an effective amount of a compound of Formula I.

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

錄

六、申請專利範圍

R^4 爲 CF_2H 、 CF_3 、 CF_2Br 、 CF_2CF_2H 、或 CF_2CF_3 。

4. 如申請專利第 1 項之化合物，其中：

R^1 爲 H；

R^2 爲 Cl；及 R^5 爲 H。

5. 如申請專利第 4 項之化合物，而選自下列化合物之中：

2-(2-氯苯基)-4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-4,5-二氫噁唑；

2-(2-氯苯基)-4-[4'-[(二氟甲基)亞磺醯基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-4,5-二氫噁唑；及

2-(2-氯苯基)-4-[4'-[(二氟甲基)磺醯基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-4,5-二氫噁唑。

6. 如申請專利第 2 項之化合物，其中：

R^5 爲 H。

7. 如申請專利第 6 項之化合物，其中：

R^4 爲 CF_2H 、 CF_3 或 CF_2Br 。

8. 如申請專利第 7 項之化合物，而選自下列化合物之中：

4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑；

4-[4'-[(二氟甲基)亞磺醯基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑；及

4-[4'-[(二氟甲基)磺醯基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑。

六、申請專利範圍

9. 如申請專利第 8 項之化合物，其為

4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑。

10. 如申請專利第 8 項之化合物，其為

4-[4'-[(二氟甲基)亞磺醯基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑。

11. 如申請專利第 8 項之化合物，其為

4-[4'-[(二氟甲基)磺醯基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑。

12. 如申請專利第 9 項之化合物，其為

(-)-4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑。

13. 如申請專利第 10 項之化合物，其為

(-)-4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑之亞碲，其中此亞碲具有 S 構形。

14. 如申請專利第 10 項之化合物，其為

(-)-4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑之亞碲，其中此亞碲具有 R 構形。

15. 如申請專利第 11 項之化合物，其為

(-)-4-[4'-[(二氟甲基)硫基][1,1'-二苯基]-4-醯基]-2-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫噁唑之碲。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

六、申請專利範圍

16. 一種殺節肢動物組合物，其包含殺節肢動物上有效份量之如申請專利範圍第1項之化合物，及至少一種界面活性劑、固態稀釋劑或液態稀釋劑。
17. 一種控制節肢動物之方法，其包含以殺節肢動物上有效份量之如申請專利範圍第1項之化合物，接觸此節肢動物或其環境。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

紅

公告本

86.7.19修正
年 月 日 補充

申請日期	85.12.17
案 號	85115590
類 別	C07D ^{26/10} , A01N ^{43/76}

(以上各欄由本局填註)

A4
C4

42K089

424089

發明專利說明書

一、發明 名稱	中 文	噁唑啉殺節肢動物劑
	英 文	Oxazoline arthropodicides
二、發明 人	姓 名	1. 傑佛瑞·隆 2. 湯瑪斯·馬丁·史蒂文生
	國 籍	1. 美國 2. 美國
	住、居所	1. 美國達拉威州維明頓淮爾大道9號 2. 美國達拉威州19702·乃沃克·艾洛奎斯廣場103號
三、申請人	姓 名 (名稱)	美商杜邦股份有限公司
	國 籍	美國
	住、居所 (事務所)	美國達拉威州一九八九八維明頓市場街一〇〇七號
	代 表 人 姓 名	馬瑞安·迪·麥克奈海

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

裝

訂

線

