

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大 類：
I P C 分類：

A6
B6

本案已向：

德 國 (地 區) 申請專利，申請日期： 案號： ， ☒ 有 ☐ 無主張優先權
西元二〇〇〇年五月十九日 10024934.5

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

五、發明說明(1)

本發明乃有關一方面包括已知之環狀酮烯醇類，另一方面包括其他已知具殺昆蟲活性的化合物之新穎之活性化合物組成物，此組成物非常適用於防治動物害蟲(例如昆蟲及討厭的蟎類)。

- 5 一般已知特定之環狀酮烯醇類化合物具有除草、殺昆蟲及殺蟎性質。這些物質活性良好，惟於低施加率時，有時無法令人滿意。。

- 具有除草、殺昆蟲及殺蟎作用之未經取代之雙環 3-芳基-吡咯啉-2,4-二酮衍生物(EP-A-355 599 及 EP-A-415 211)
10 與經取代之單環 3-芳基-吡咯啉-2,4-二酮衍生物(EP-A-377 893 及 EP-A-442 077)係已知之化合物。

- 其他已知者為多環 3-芳基吡咯啉-2,4-二酮衍生物(EP-A-442 073)及 1H-芳基吡咯啉-二酮衍生物(EP-A-456 063、EP-A-521 334、EP-A-596 298、EP-A-613 884、
15 EP-A-613 885、WO 94/01 997、WO 95/26 954、WO 95/20 572、EP-A-0 668 267、WO 96/25 395、WO 96/35 664、WO 97/01 535、WO 97/02 243、WO 97/36 868、WO 97/43 275、WO 98/05 638、WO 98/06 721、WO 98/25 928、WO 99/16 748、WO 99/24 437、WO 99/43 649、WO 99/48 869 及 WO
20 99/55 673)。

此外，亦已知許多雜環類、有機錫化合物、苯甲醯脲類及擬除蟲菊酯類化合物具有殺昆蟲及殺蟎性質(參照 WO 93-22 297、WO 93-10 083、DE-A-2 641 343、EP-A-347 488、EP-A-210 487、US 3,364,177 及 EP-A-234 045)。然

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

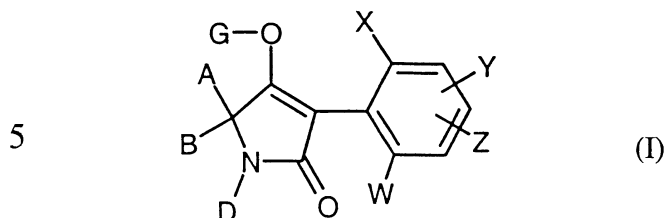
裝

訂

五、發明說明(2)

而，這些物質之活性常無法令人滿意。

頃發現含有式(I)化合物



式中

X 代表鹵基、烷基、烷氧基、鹵烷基、鹵烷氧基或氰基，
W、Y 與 Z 各自獨立地代表氫、鹵基、烷基、烷氧基、鹵
10 烷基、鹵烷氧基或氰基，

A 代表氫、於各情形下視需要經鹵基取代之烷基、烷氧
基烷基、飽和、視需要經取代之環烷基，其中視需要
至少一個環原子被雜原子置換，

B 代表氫或烷基，

15 A 和 B 及與其連接的碳原子一起代表飽和或不飽和、未經
取代或經取代、視需要含有至少一個雜原子之環，

D 代表氫或視需要經取代之下列基團：烷基、烯基、烷
氧基烷基、飽和環烷基，其中環烷基視需要有一或多
個環員被雜原子置換，

20 A 和 D 及與其連接之諸原子一起代表飽和或不飽和環，其
中 A、D 基團為未經取代或經取代，及該環視需要含
有至少一個雜原子，

G 代表氫(a)或代表下列基團之一

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝訂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)



E 代表金屬離子或銨離子，

M 代表氧或硫，

- 15 R² 代表於各情形下視需要經鹵基取代之烷基、烯基、烷
氧基烷基、多烷氧基烷基或代表於各情形下視需要經
取代之環烷基、苯基或苄基，

20 R⁴ 及 R⁵ 各自獨立地代表於各情形下視需要經鹵基取代之
 烷基、烷氧基、烷胺基、二烷胺基、烷硫基、烯硫基、
 環烷硫基或代表於各情形下視需要經取代之苯基、苄
 基、苯氧基或苯硫基，及

5

五、發明說明(4)

代之烷基、環烷基、烯基、烷氧基、烷氧基烷基、代表視需要經取代之苯基、代表視需要經取代之苄基或和與其連接的氮原子一起代表視需要經取代之環，該環視需要被氧或硫介入，

- 5 及至少一種式(II)之乙醯膽鹼受體之激動劑或拮抗劑之混合物具有增效活性，適用於防治動物害蟲。

視取代基之性質而定，式(I)化合物可呈不同組成之幾何及/或光學異構物或異構物混合物存在，如果適當，可以習知方法將其分離。本發明提供純異構物、異構物混合物、
10 其製法與用途，及包含彼等之組成物。下文中，為了簡化，僅簡稱式(I)化合物，惟此意指純化合物及，如果適當，為具有不同比例異構物化合物之混合物。

菸鹼酸乙醯膽鹼之激動劑與拮抗劑為自下述文獻得知之已知化合物：

- 15 歐洲專利公開案 464 830、428 941、425 978、386 565、383 091、375 907、364 844、315 826、259 738、254 859、235 725、212 600、192 060、163 855、154 178、136 636、136 686、303 570、302 833、306 696、189 972、455 000、135 956、471 372、302 389、428 941、376 279、493 369、
20 580 553、649 845、685 477、483 055、580 553；

德國專利公開案 3 639 877、3 712 307；

日本專利公開案 03 220 176、02 207 083、63 307 857、63 287 764、03 246 283、04 9371、03 279 359、03 255 072、05 178 833、07 173 157、08 291 171；

五、發明說明 (5)

美國專利案 5 034 524、4 948 798、4 918 086、5 039 686、5 034 404、5 532 365；

PCT 申請案 WO 91/17 659、91/4965；

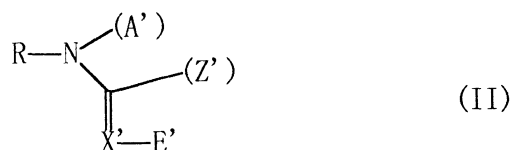
法國專利申請案 2 611 114；

5 巴西專利申請案 88 03 621。

這些文獻敘述之化學式及界定，以及其中所述之各個化合物，均併入本文以資參考。

這些化合物有些係歸納於硝基伸甲基類、硝基亞胺類及相關化合物。

10 較好，這些化合物歸納為式(II)：



式中

R 代表氫或代表視需要經取代之下列基團：鹼基、烷基、芳基、芳烷基、雜環基、雜芳基及雜芳基烷基；

15 A' 代表下列單官能基團：氫、鹼基、烷基、芳基，或代表連接於 Z' 之雙官能基；

E' 代表吸電子基團；

X' 代表 -CH= 或 =N- 基團，其中 -CH= 可連接於 Z' 而非 H 原子；

20 Z' 代表下列單官能基團：烷基、-O-R、-S-R、 $\begin{array}{c} \text{R} \\ \diagup \text{N} \diagdown \\ \text{R} \end{array}$ ，
其中 R 可相同或不同且係如上所界定，或代表連接於

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (6)

A' 或 X' 之雙官能基。

特佳者為式(II)化合物中諸基團具有下述意義：

R 代表氫及代表視需要經取代之下列基團：醯基、烷基、芳基、芳烷基、雜環基烷基、雜芳基、雜芳基烷基。

5

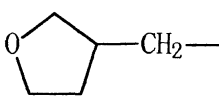
醯基實例為甲醯基、烷羰基、芳羰基、烷磺醯基、芳磺醯基、(烷基-)-(芳基-)-磷醯基，其本身可經取代。

烷基實例為 C_1 - C_{10} 烷基，特別是 C_1 - C_4 烷基，詳言之，為甲基、乙基、異丙基、第二-或第三-丁基，其本身可經取代。

10

芳基實例為苯基、萘基，特別是苯基。

芳烷基實例為苯基甲基、苯乙基。

雜環基烷基實例為 。

雜芳基烷基實例為具有至多達 6 個環原子及含有雜原子 N、O、S，特別是 N 之雜芳基甲基、雜芳基乙基，特別是如前述界定的雜芳基之視需要經取代之雜芳基。

15

可提及之取代基實例較佳者為：較好具有 1 至 4 個(特別是 1 或 2 個)碳原子之烷基，例如甲基、乙基、正-與異-丙基及正-、異-與第三-丁基；較好具有 1 至 4 個(特別是 1 或 2 個)碳原子之烷氧基，例如甲氧基、乙氧基、正-與異-丙氧基及正-、異-與第三-丁氧基；較好具有 1 至 4 個(特別是 1 或 2 個)碳原子之烷硫基，

20

五、發明說明(7)

- 例如甲硫基、乙硫基、正-與異-丙硫基及正-、異-與第三-丁硫基；較好具有 1 至 4 個(特別是 1 或 2 個)碳原子及較好具有 1 至 5 個(特別是 1 或 3 個)鹵原子之鹵烷基，其中鹵原子可相同或不同，且較好為氟、氯或溴，特別是氟，例如三氟甲基；羥基；鹵基，較好為氟、氯、溴及碘，特別是氟、氯及溴；氰基；硝基；胺基；每一烷基較好具有 1 至 4 個(特別是 1 或 2 個)碳原子之單烷基-及二烷基-胺基，例如甲胺基、甲基乙胺基、正-與異-丙胺基及甲基-正-丁胺基；羧基；較好具有 2 至 4 個(特別是 2 或 3 個)碳原子之烷氧羰基，例如甲氧羰基及乙氧羰基；磺酸基(-SO₃H)；較好具有 1 至 4 個(特別是 1 或 2 個)碳原子之烷基磺醯基，例如甲基磺醯基及乙基磺醯基；較好具有 6 或 10 個芳基碳原子之芳基磺醯基，例如苯基磺醯基；以及雜芳基胺基及雜芳基烷胺基例如氯吡啶基胺基及氯吡啶基甲胺基。
- A' 代表氫或代表視需要經取代之下列基團：醯基、烷基、芳基，該等基團較好如 R 中之界定，A' 進一步代表雙官能基，其實例包含視需要經取代之具有 1 至 4 個(特別是 1 或 2 個)C 原子之伸烷基，取代基之實例為前文所列之取代基(及其中伸烷基可被 N、O、S 雜原子介入)。
- A' 與 Z' 可和與其連接之諸原子一起，形成飽和或不飽和雜環。該雜環可進一步含有 1 或 2 個相同或不同的雜原

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

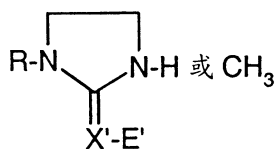
訂

象

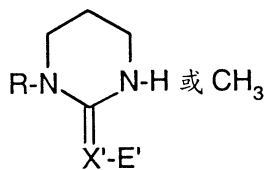
五、發明說明 (8)

子及/或雜基。較佳之雜原子為氧、硫或氮，及較佳之雜基為 N-烷基，其中 N-烷基之烷基含有 1 至 4 個(特別是 1 或 2 個)碳原子。烷基之實例包含甲基、乙基、正-及異-丙基、及正-、異-及第三-丁基。雜環含有 5

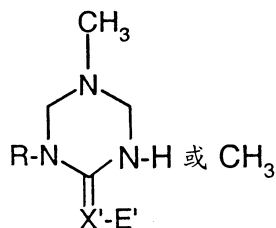
至 7 個，較佳為 5 或 6 個環員。
式(II)化合物中，A'與 Z'和與其連接之諸原子一起形成環之實例如下：



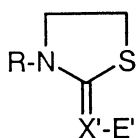
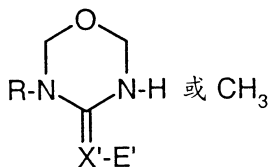
10



15

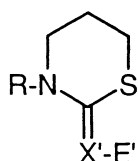


20



10

五、發明說明(9)



式中

5 E'、R 與 X' 各係如上文及下文所界定。

E' 代表吸電子基團，其詳細實例為 NO₂、CN、鹵烷基羰基(如鹵基-C₁-C₄-烷基羰基，例如 COCF₃)、烷基磺醯基(例如 SO₂-CH₃)、鹵烷基磺醯基(例如 SO₂CF₃)，特佳者為 NO₂ 或 CN。

10 X' 代表 -CH= 或 =N-。

Z' 代表視需要經取代之下列基團：烷基、-OR、-SR、-NRR，其中 R 及取代基較好如上界定。

Z' 除了上述環之外，可和與其連接之原子及基團

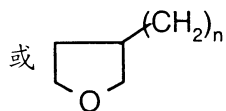
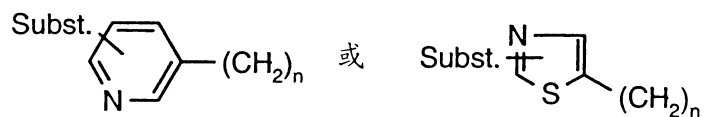
=C— (而非 X') 一起，形成飽和或不飽和雜環。該雜

15 環可進一步含有 1 或 2 個相同或不同的雜原子及/或雜基。較佳之雜原子為氧、硫或氮，及較佳之雜基為 N-烷基，其中 N-烷基之烷基含有 1 至 4 個(特別是 1 或 2 個)碳原子。烷基之實例包含甲基、乙基、正-及異-丙基、及正-、異-及第三-丁基。雜環含有 5 至 7 個，較佳為 5 或 6 個環員。其實例包含吡咯啉、哌啉、哌啶、六伸甲基亞胺、嗎啉及 N-甲基哌啶。

20 菸鹼酸乙醯膽鹼受體的激動劑及拮抗劑特佳者為式 (II) 化合物中：

五、發明說明 (10)

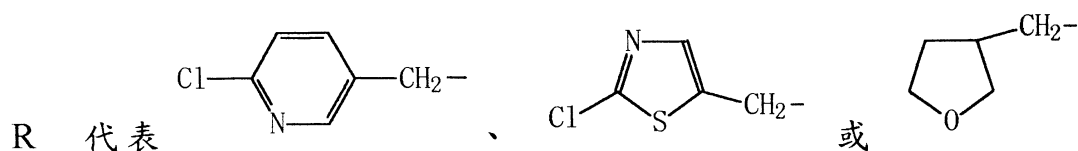
R 代表



5 其中

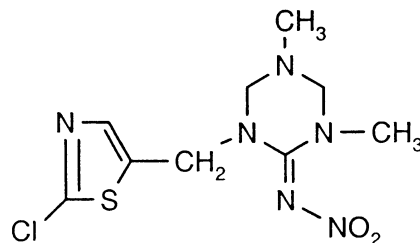
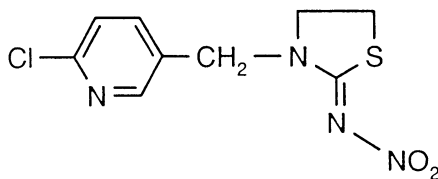
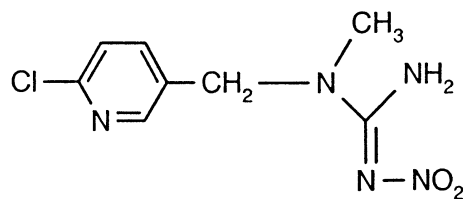
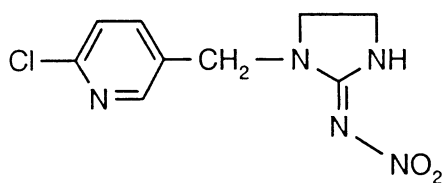
n 代表 0、1 或 2，較好代表 1，

Subst.代表上述取代基之一者，尤為鹵基，特別是氯，
A'、Z'、X'及 E'各係如上界定者。特別是



10 者。

下述化合物為詳細實例：

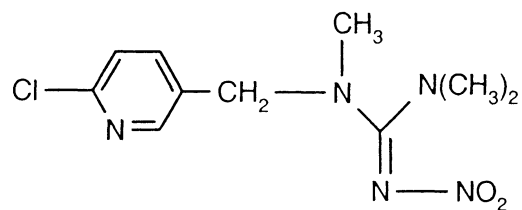
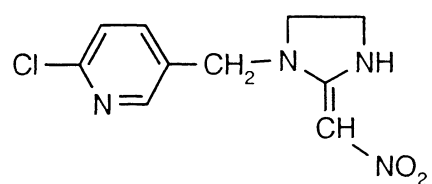
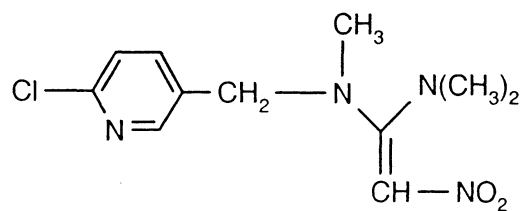
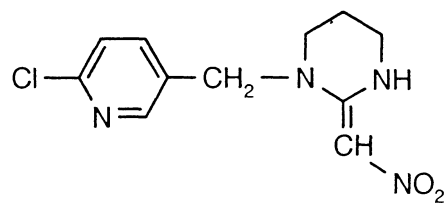
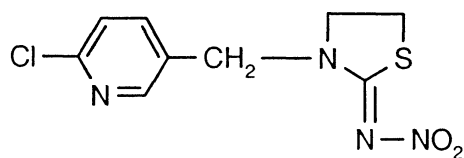
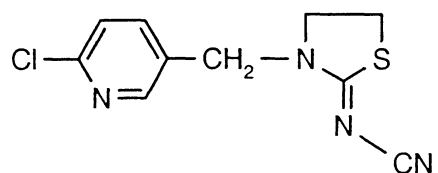
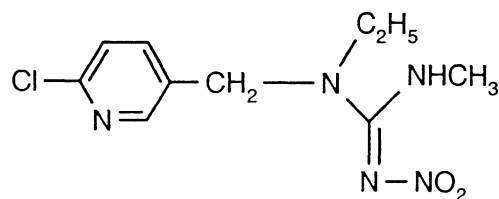
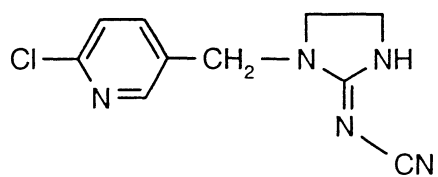
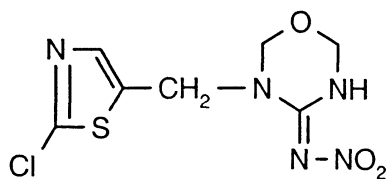
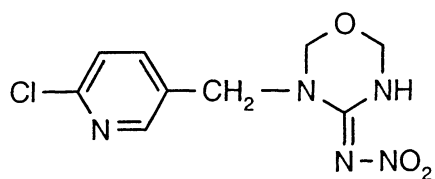
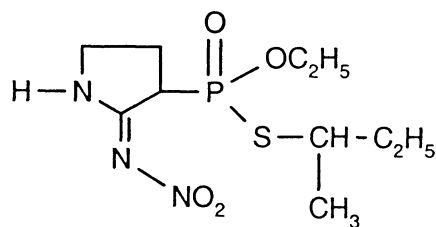
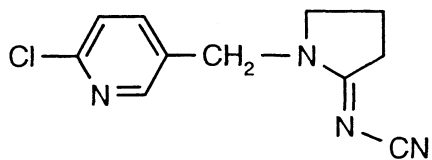


(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (11)

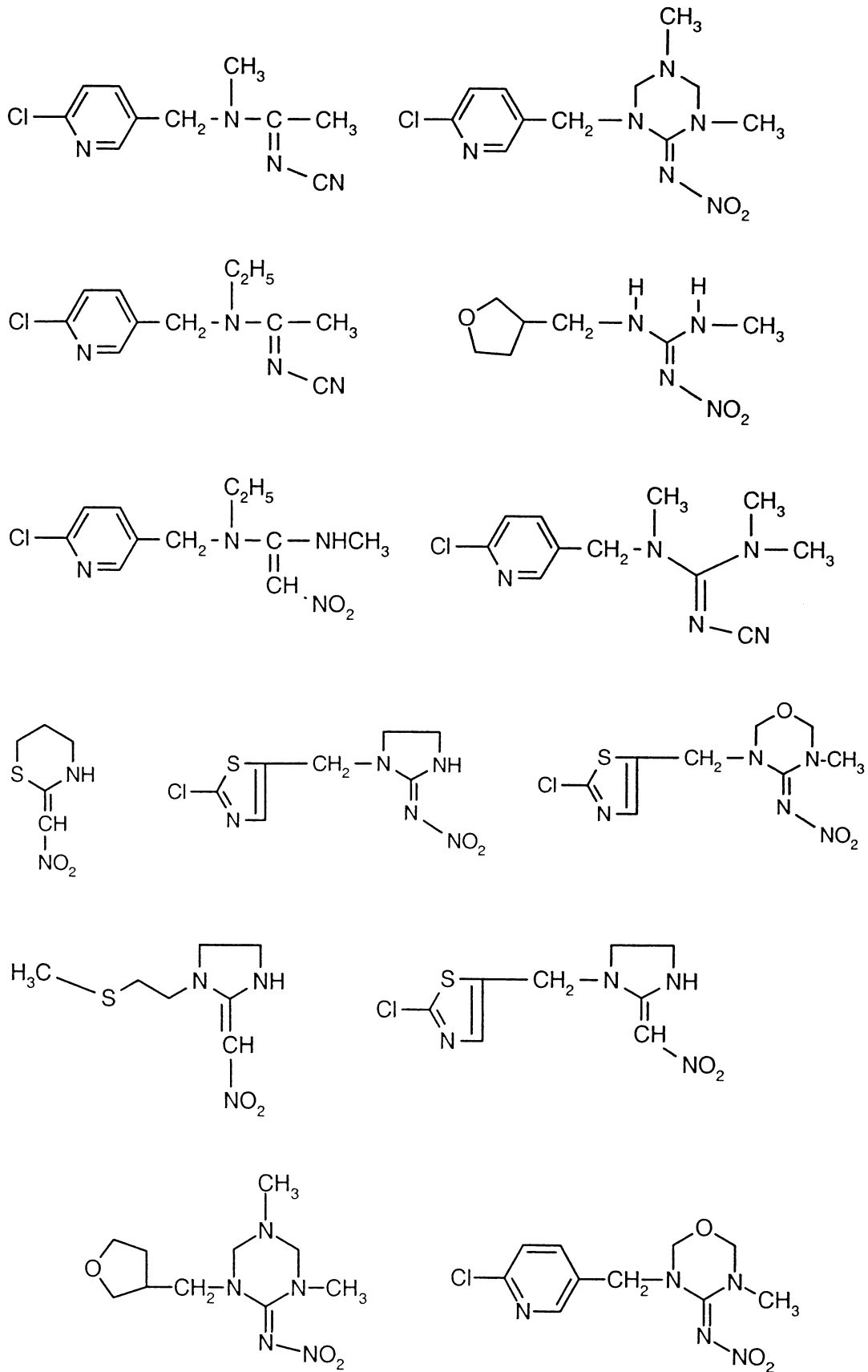


(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (12)

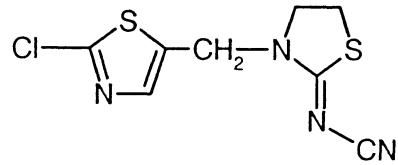
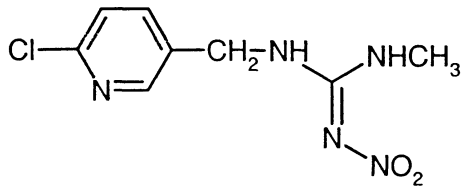


(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

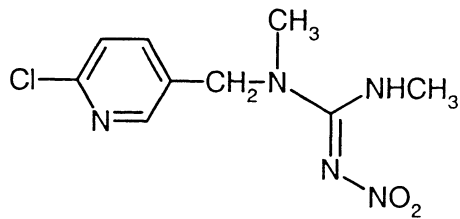
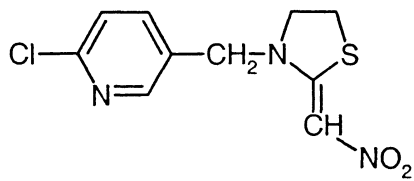
裝

訂

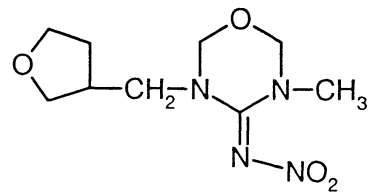
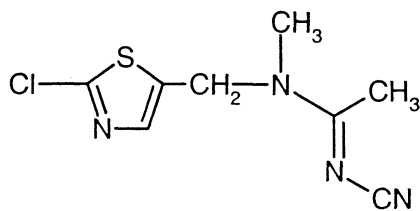
五、發明說明 (13)



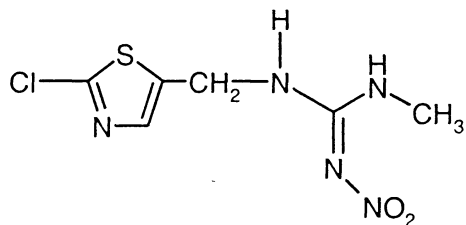
5



10



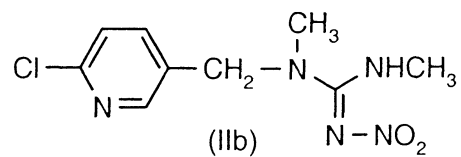
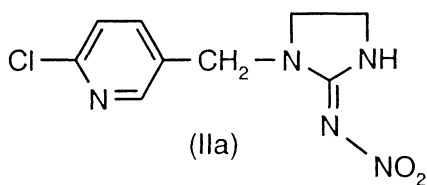
15



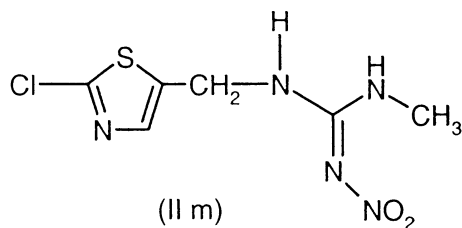
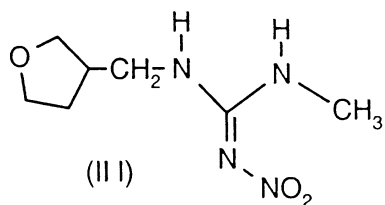
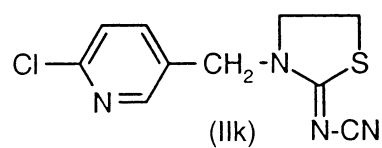
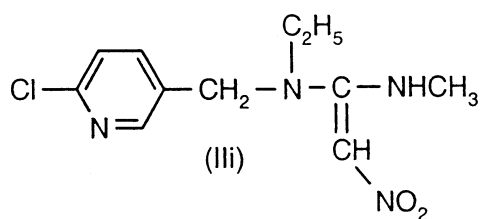
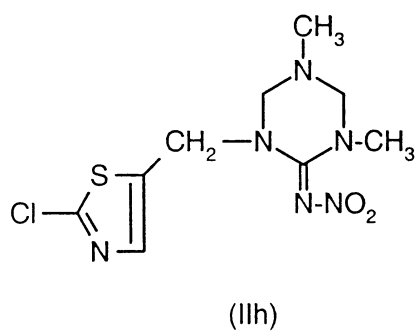
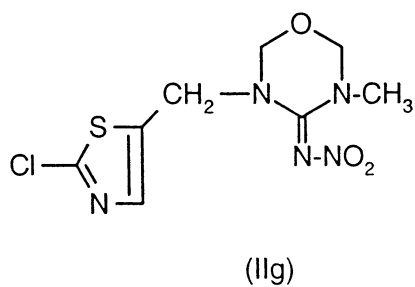
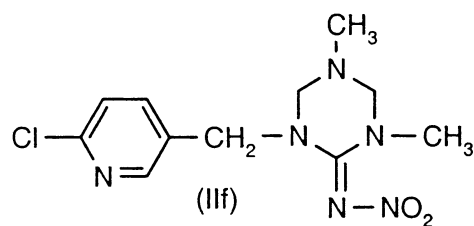
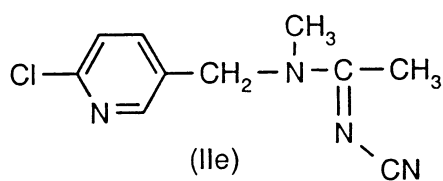
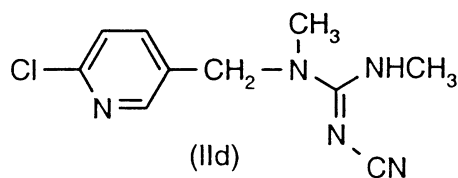
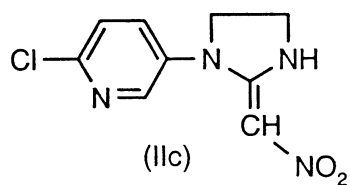
菸鹼酸乙醯膽鹼受體非常特佳之激動劑及拮抗劑為具

下述諸式之化合物：

20



五、發明說明 (14)



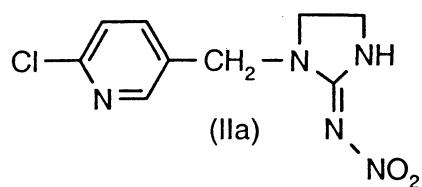
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

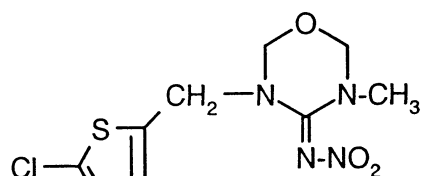
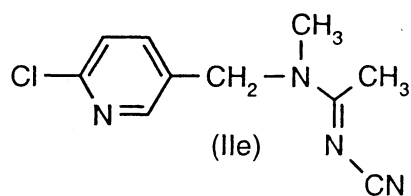
訂

五、發明說明 (15)

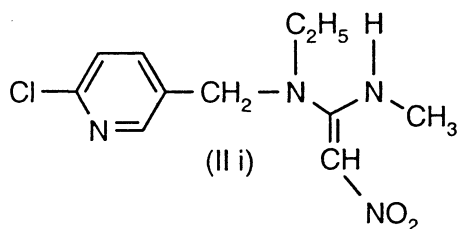
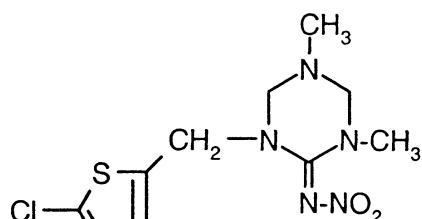
特別是具下述諸式之化合物：



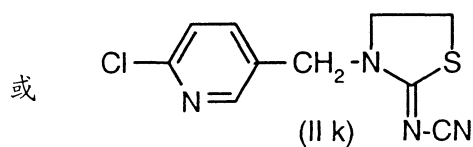
或



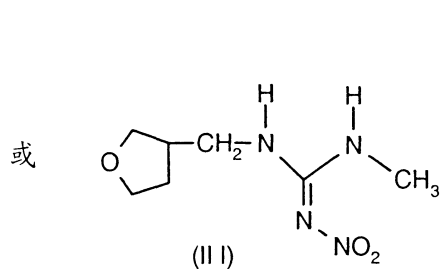
或



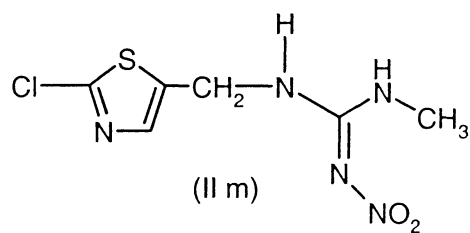
或



或



或



五、發明說明 (16)

極特佳者為式(IIa)與(IIk)之化合物。

進一步地，極特佳者為式(IIe)、(IIg)、(IIh)、(III)、(IIc)與(IIm)之化合物。

較佳之活性化合物組成係包括式(I)化合物，其中諸基

5 團如下述界定：

W 較好代表氫、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、氯、溴或氟，

X 較好代表 C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-鹵烷基、氟、氯或溴，

10 Y 與 Z 較好各自獨立地代表氫、C₁-C₄-烷基、鹵基、C₁-C₄-烷氧基或 C₁-C₄-鹵烷基，

A 較好代表氫或於各情形下視需要經鹵基取代之 C₁-C₆-烷基或 C₃-C₈-環烷基，

B 較好代表氫、甲基或乙基，

15 A、B 和與其連接之碳原子較好代表飽和之 C₃-C₆-環烷基，其視需要有一環員被氧或硫取代，及視需要被 C₁-C₄-烷基-、三氟甲基-或 C₁-C₄-烷氧基-單-或二取代，

D 較好代表氫、於各情形下視需要被氟-或氯-取代之 C₁-C₆-烷基、C₃-C₄-烯基或 C₃-C₆-環烷基，

20 A 與 D 一起較好代表於各情形下視需要被甲基取代之 C₃-C₄-烷二基，其中視需要有一伸甲基被硫取代，

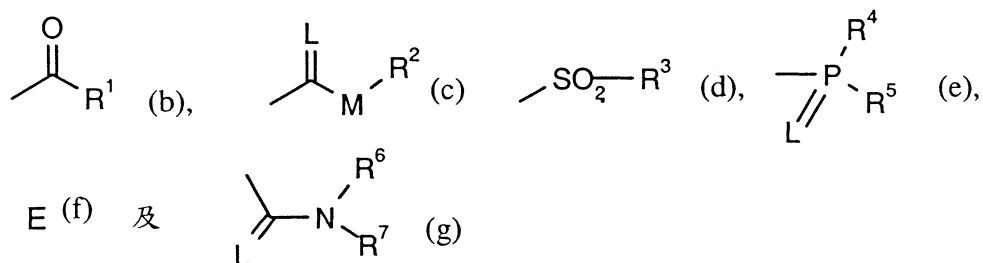
G 代表氫(a)或代表下述基團：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (17)



5

特別是(a)、(b)、(c)或(g)

其中

E 代表金屬離子或銨離子，

L 代表氧或硫及

10 M 代表氧或硫，

R¹ 較好代表於各情形下視需要經鹵基取代之 C₁-C₁₀-烷基、C₂-C₁₀-烯基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基或視需要經氟-、氯-、C₁-C₄-烷基-或 C₁-C₂-烷氧基-取代之 C₃-C₆-環烷基，

15 代表視需要經氟-、氯-、溴-、氰基-、硝基-、C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-烷氧基-、三氟甲基-或三氟甲氧基-取代之苯基，

代表於各情形下視需要經氯-或甲基-取代之吡啶基或噻吩基，

20 R² 較好代表於各情形下視需要經氟-或氯-取代之 C₁-C₁₀-烷基、C₂-C₁₀-烯基或 C₁-C₄-烷氧基-C₂-C₄-烷基，

代表視需要經甲基-或甲氧基-取代之 C₅-C₆-環烷基或

代表於各情形下視需要經氟-、氯-、溴-、氰基-、硝基-、C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-烷氧基-、三氟甲基-或三氟甲

五、發明說明 (¹⁸)

氧基-取代之苯基或苄基，

R³ 較好代表視需要經氟-取代之 C₁-C₄-烷基或代表視需要經氟-、氯-、溴-、C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-烷氧基-、三氟甲基-、三氟甲氧基-、氰基-或硝基-取代之苯基，

5 R⁴ 較好代表於各情形下視需要經氟-或氯-取代之 C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷胺基、C₁-C₄-烷硫基或代表於各情形下視需要經氟-、氯-、溴-、硝基-、氰基-、C₁-C₄-烷氧基-、三氟甲氧基-、C₁-C₄-烷硫基-、C₁-C₄-鹵烷硫基-、C₁-C₄-烷基-或三氟甲基-取代之苯基、苯氧基或苯硫基，

10

R⁵ 較好代表 C₁-C₄-烷氧基或 C₁-C₄-烷硫基，

R⁶ 較好代表 C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-環烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₃-C₆-烯基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基，

R⁷ 較好代表 C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-烯基或 C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基，

15

R⁶ 與 R⁷ 一起較好代表視需要經甲基-或乙基-取代之 C₃-C₆伸烷基，其中視需要有一碳原子被氧或硫取代。

W 特佳為代表氫、甲基、乙基、氯、溴或甲氧基，

X 特佳為代表氯、溴、甲基、乙基、丙基、異丙基、甲氧基、乙氧基或三氟甲基，

20

Y 與 Z 各自獨立地代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基、丙基、異丙基、三氟甲基或甲氧基，

A 特佳為代表甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、異丁基、第二丁基、第三丁基、環丙基、環戊基或環己基，

五、發明說明 (19)

B 特佳為代表氫、甲基或乙基，

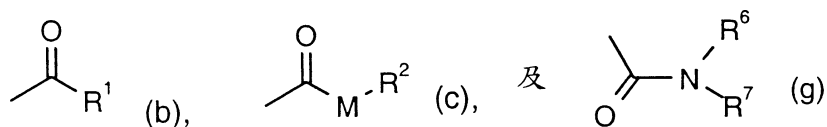
A、B 和與其連接之碳原子特佳為代表飽和之 C_3-C_6 -環烷基，其視需要有一環員被氧取代，及視需要被甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、丙氧基或丁氧基單取代，

5 D 特佳為代表氫，代表甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、異丁基、烯丙基、環丙基、環戊基或環己基，

A 與 D 一起特佳為代表視需要被甲基取代之 C_3-C_4 -烷二基，

G 特佳為代表氫(a)或代表下述基團：

10



其中

M 代表氧或硫，

15 R^1 特佳為代表 C_1-C_8 -烷基、 C_2-C_4 -烯基、甲氧甲基、乙氧甲基、乙硫基甲基、環丙基、環戊基或環己基，
代表視需要經氟-、氯-、溴-、氰基-、硝基-、甲基-、乙基-、甲氧基-、三氟甲基-或三氟甲氧基-取代之苯基，
代表於各情形下視需要經氯-或甲基-取代之吡啶基或噻吩基，

20

R^2 特佳為代表 C_1-C_8 -烷基、 C_2-C_4 -烯基、甲氧乙基、乙氧乙基或代表苯基或苄基，

R^6 與 R^7 特佳為各自獨立地代表甲基或乙基或一起代表 C_3-C_5 -伸烷基，其中 C_3 -伸甲基被氧取代。

五、發明說明 (20)

W 極特佳為代表氫或甲基，

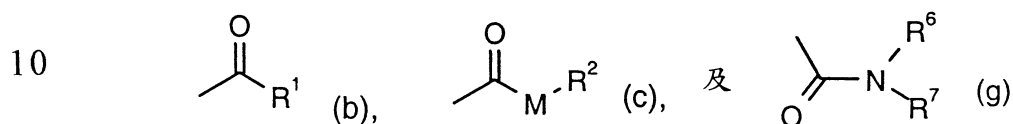
X 極特佳為代表氯、溴或甲基，

Y 與 Z 極特佳為各自獨立地代表氫、氯、溴或甲基，

5 A、B 和與其連接之碳原子極特佳為代表飽和之 C₃-C₆-環
烷基，其視需要有一環員被氧取代，及視需要被甲基、
甲氧基、乙氧基、丙氧基或丁氧基單取代，

D 極特佳為代表氫，

G 極特佳為代表氫(a)或代表下述基團：



其中

M 代表氧或硫，

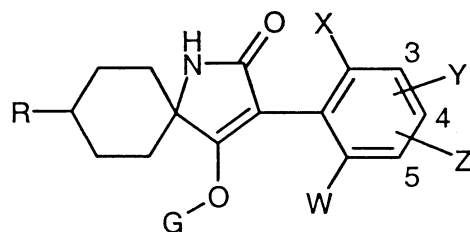
15 R¹ 極特佳為代表 C₁-C₈-烷基、C₂-C₄-烯基、甲氧甲基、
乙氧甲基、乙基甲硫基、環丙基、環戊基、環己基或
代表視需要經氟-、氯-、溴-、甲基-、甲氧基-、三氟
甲基-、三氟甲氧基-、氰基-或硝基-取代之苯基，
代表於各情形下視需要經氯-或甲基-取代之吡啶基或
噻吩基，

20 R² 極特佳為代表 C₁-C₈-烷基、C₂-C₄-烯基、甲氧乙基、
乙氧乙基、苯基或苄基，

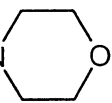
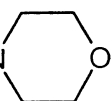
R⁶ 與 R⁷ 極特佳為各自獨立地代表甲基、乙基或一起代表
C₃-C₅ 伸烷基，其中 C₃-伸甲基被氧取代。

特佳之活性化合物組成包括下述式(I)化合物：

五、發明說明 (21)



(I)

實驗編號	W	X	Y	Z	R	G	m.p.°C
I-1	H	Br	5-CH ₃	H	OCH ₃	CO-i-C ₃ H ₇	122
I-2	H	Br	5-CH ₃	H	OCH ₃	CO ₂ -C ₂ H ₅	140 - 142
I-3	H	CH ₃	5-CH ₃	H	OCH ₃	H	> 220
I-4	H	CH ₃	5-CH ₃	H	OCH ₃	CO ₂ -C ₂ H ₅	128
I-5	CH ₃	CH ₃	3-Br	H	OCH ₃	H	> 220
I-6	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H	OCH ₃	H	219
I-7	H	Br	4-CH ₃	5-CH ₃	OCH ₃	CO-i-C ₃ H ₇	217
I-8	H	CH ₃	4-Cl	5-CH ₃	OCH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	162
I-9	H	CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃	OCH ₃	CO-N 	油狀物
I-10	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	4-CH ₃	OCH ₃	H	>220
I-11	H	CH ₃	5-CH ₃	H	OC ₂ H ₅	CO-N 	油狀物
I-12	CH ₃	CH ₃	3-Br	H	OC ₂ H ₅	CO-i-C ₃ H ₇	212 - 214
I-13	H	CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃	OC ₂ H ₅	CO-n-Pr	134
I-14	H	CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃	OC ₂ H ₅	CO-i-Pr	108
I-15	H	CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃	OC ₂ H ₅	CO-c-Pr	163

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

東

五、發明說明 (22)

根據本發明之活性化合物組成物植物之耐受性良好且對溫血動物不具毒性，適用於防治動物害物，特別是農業、動物保健、森林、貯存產品及物料之保護及衛生領域上所見之昆蟲、蟬蟎及線蟲，而宜用為作物保護劑。彼等對於

5 一般敏感及有抗性之品系，及所有或各個發育階段均具活性。上述害物包含：

屬於等足目(Isopoda)者，例如，海蛆屬之 *Oniscus asellus*、*Armadillidium vulgare*、*Porcellio scaber*。

屬於雙足目(Diplopoda)者，例如，*Blaniulus guttulatus*。

10 屬於唇足目(Chilopoda)者，例如，地蜈蚣屬之 *Geophilus carpophagus*、蚰蜒屬(*Scutigera spp.*)。

屬於綜合目(Symphyla)者，例如，*Scutigera immaculata*。

15 屬於纓尾目(Thysanura)者，例如，西洋衣魚(*Lepisma saccharina*)。

屬於彈尾目(Collembola)者，例如，棘跳蟲屬之 *Onychiurus armatus*。

屬於直翅目(Orthoptera)者，例如，家蟋蟀(*Acheta domesticus*)、螻蛄屬(*Gryllotalpa spp.*)、熱帶飛蝗(*Locusta migratoria migratorioides*)、蚱蜢屬(*Melanoplus spp.*)、群居蚱蜢(*Schistocerca gregaria*)。

20

屬於蜚蠊目(Blattaria)者，例如，東方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、美洲大蠊(*Periplaneta americana*)、馬得拉蜚蠊(*Leucophaea maderae*)、德國小蠊(*Blattella germanica*)。

五、發明說明 (23)

屬於革翅目(Dermaptera)者，例如，歐洲球蝨(*Forficula auricularia*)。

屬於等翅目(Isoptera)者，例如，白蟻屬(*Reticulitermes spp.*)。

- 5 屬於蝨目(Phthiraptera)者，例如，衣虱(*Pediculus humanus corporis*)、盲虱屬(*Haematopinus spp.*)、長顎虱屬(*Linognathus spp.*)、羽虱屬(*Trichodectes spp.*)、*Damalinia* 屬。

- 10 屬於纓翅目(Thysanoptera)者，例如，溫室條薊馬(*Hercinothrips femoralis*)、薊馬(*Thrips tabaci*)、棕櫚薊馬(*Thrips palmi*)、苜蓿薊馬(*Frankliniella occidentalis*)。

- 屬於異翅亞目(Heteroptera)者，例如，褐盾蝽屬(*Eurygaster spp.*)、紅蝽屬之 *Dysdercus intermedius*、甜菜擬網蝽(*Piesma quadrata*)、臭蟲(*Cimex lectularius*)、
15 *Rhodnius prolixus*、獵蝽屬(*Triatoma spp.*)。

- 屬於同翅目(Homoptera)者，例如，甘藍粉虱(*Aleurodes brassicae*)、粉虱(*Bemisia tabaci*)、溫室白粉虱(*Trialeurodes vaporariorum*)、棉蚜(*Aphis gossypii*)、甘藍蚜(*Brevicoryne brassicae*)、茶蔗隱瘤額蚜(*Cryptomyzus ribis*)、蚕豆蚜(*Aphis fabae*)、蘋果蚜(*Aphis pomi*)、蘋果棉
20 蚜(*Eriosoma lanigerum*)、桃大尾蚜(*Hyalopterus arundinis*)、美核桃根瘤蚜(*Phylloxera vastatrix*)、癭棉蚜屬(*Pemphigus spp.*)、麥長管蚜(*Macrosiphum avenae*)、瘤額蚜屬(*Myzus spp.*)、*Phorodon humuli*、粟縊管蚜

五、發明說明 (²⁴)

(*Rhopalosiphum padi*)、葉蟬屬(*Empoasca spp.*)、二葉葉蟬
 (*Euscelis bilobatus*)、黑尾葉蟬(*Nephotettix cincticeps*)、李
 蠟蚧(*Lecanium corni*)、油橄欖盔蚧(*Saissetia oleae*)、稻灰
 飛虱(*Laodelphax striatellus*)、稻褐飛虱(*Nilaparvata*
 5 *lugens*)、紅圓蚧(*Aonidiella aurantii*)、圓蚧屬之 *Aspidiotus*
hederae、粉蚧屬(*Pseudococcus spp.*)、木虱屬(*Psylla spp.*)。

屬於鱗翅目(*Lepidoptera*)者，例如，紅鈴蟲
 (*Pectinophora gossypiella*)、松尺蠖(*Bupalus piniarius*)、
Cheimatobia brumata、細蛾屬之 *Lithocolletis*
 10 *blancardella*、櫻桃巢蛾(*Hyponomeuta padella*)、小菜蛾
 (*Plutella xylostella*)、天幕毛蟲(*Malacosoma neustria*)、毒
 屬之 *Euproctis chrysorrhoea*、毒蛾屬(*Lymantria spp.*)、棉
 葉穿孔潛蛾(*Bucculatrix thurberiella*)、*Phyllocnistis*
citrella、地老虎屬(*Agrotis spp.*)、切根蟲屬(*Euxoa spp.*)、
 15 褐夜蛾屬(*Feltia spp.*)、埃及金剛鑽(*Earias insulana*)、夜蛾
 屬(*Heliothis spp.*)、甘藍夜蛾(*Mamestra brassicae*)、*Panolis*
flammea、黏蟲屬(*Spodoptera spp.*)、粉紋夜蛾(*Trichoplusia*
ni)、蘋果蠹蛾(*Carpocapsa pomonella*)、粉蝶屬(*Pieris*
spp.)、螟屬(*Chilo spp.*)、野螟屬之 *Pyrausta nubilalis*、粉
 20 螟屬之 *Ephestia kuehniella*、大蠟螟(*Galleria mellonella*)、
 袋衣蛾(*Tineola bisselliella*)、網衣蛾(*Tinea pellionella*)、褐
 織葉蛾(*Hofmannophila pseudospretella*)、捲葉蛾屬之
Cacoecia podana、*Capua reticulana*、雲杉捲葉蛾
 (*Choristoneura fumigerana*)、葡萄果蠹蛾(*Clysia*

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (25)

ambiguella)、捲葉蛾屬之 *Homona magnanima*、櫟綠捲葉蛾(*Tortrix viridana*)、捲螟屬(*Cnaphalocerus spp.*)、稻負泥蟲(*Oulema oryzae*)。

- 屬於鞘翅目(Coleoptera)者，例如，家具竊蠹(*Anobium*
 5 *punctatum*)、谷蠹屬之 *Rhizopertha dominica*、豆象屬之
Bruchidius obtectus、大豆象(*Acanthoscelides obtectus*)、家
 天牛(*Hylotrupes bajulus*)、*Agelastica alni*、馬鈴薯甲蟲
(Leptinotarsa decemlineata)、猿葉蟲屬之 *Phaedon*
cochleariae、葉甲屬(*Diabrotica spp.*)、油菜蘭跳甲
 10 *(Psylliodes chrysocephala)*、墨西哥豆瓢蟲(*Epilachna*
varivestis)、*Atomaria spp.*、鋸谷盜(*Oryzaephilus*
surinamensis)、象甲屬(*Anthonomus spp.*)、象鼻蟲屬
(Sitophilus spp.)、深溝象甲(*Otiorrhynchus sulcatus*)、香蕉
 蛀基象甲(*Cosmopolites sordidus*)、甘藍莢象甲
 15 *(Ceuthorrhynchus assimilis)*、苜蓿葉象甲(*Hypera*
postica)、皮蠹屬(*Dermestes spp.*)、斑皮蠹屬(*Trogoderma*
spp.)、皮蠹屬(*Anthrenus spp.*)、黑皮蠹屬(*Attagenus spp.*)、
 粉蠹屬(*Lyctus spp.*)、*Meligethes aeneus*、蛛甲屬(*Ptinus*
spp.)、金黃珠甲(*Niptus hololeucus*)、麥珠甲(*Gibbium*
 20 *psylloides*)、粉甲屬(*Tribolium spp.*)、黃粉甲(*Tenebrio*
molitor)、叩甲屬(*Agriotes spp.*)、金針蟲屬(*Conoderus*
spp.)、鰓角金龜(*Melolontha melolontha*)、六月金龜
(Amphimallon solstitialis)、*Costelytra zealandica*、稻象甲
(Lissorhoptrus oryzophilus)。

五、發明說明 (26)

屬於膜翅目(Hymenoptera)者，例如，鋸角葉蜂屬(*Diprion spp.*)、葉蜂屬(*Hoplocampa spp.*)屬、蟻屬(*Lasius spp.*)、廚蟻(*Monomorium pharaonis*)、胡蜂屬(*Vespa spp.*)。

屬於雙翅目(Diptera)者，例如，伊蚊屬(*Aedes spp.*)、

- 5 按蚊屬(*Anopheles spp.*)、庫蚊屬(*Culex spp.*)、黃猩猩果蠅(*Drosophila melanogaster*)、家蠅屬(*Musca spp.*)、廐蠅屬(*Fannia spp.*)、紅頭麗蠅(*Calliphora erythrocephala*)、綠蠅屬(*Lucilia spp.*)、*Chrysomya spp.*、疽蠅屬(*Cuterebra spp.*)、胃蠅屬(*Gastrophilus spp.*)、*Hyppobosca spp.*、螫蠅
- 10 屬(*Stomoxys spp.*)、狂蠅屬(*Oestrus spp.*)、皮蠅屬(*Hypoderma spp.*)、牛虻屬(*Tabanus spp.*)、夜蟬屬(*Tannia spp.*)、毛蚊屬之 *Bibio hortulanus*、瑞典麥杵蠅(*Oscinella frit*)、*Phorbia spp.*、甜菜潛葉蠅(*Pegomyia hyoscyami*)、地中海實蠅(*Ceratitis capitata*)、油橄欖實蠅(*Dacus oleae*)、
- 15 歐洲大蚊(*Tipula paludosa*)、種蠅屬(*Hylemyia spp.*)、潛蠅屬(*Liriomyza spp.*)。

屬於蚤目(Siphonaptera)者，例如，東方鼠蚤(*Xenopsylla cheopis*)、蚤屬(*Ceratophyllus spp.*)。

- 屬於蛛形目(Arachnida)者，例如，*Scorpio maurus*、黑
- 20 寡婦球腹蛛(*Latrodectus mactans*)、粗腳粉蟎(*Acarus siro*)、禽壁蝨屬(*Argas spp.*)、鈍喙蜱屬(*Ornithodoros spp.*)、雞皮刺蟎(*Dermanyssus gallinae*)、癭蟎屬之 *Eriophyes ribis*、橘銹蟎(*Phyllocoptrura oleivora*)、蜱屬(*Boophilus spp.*)、扇頭蜱屬(*Rhipicephalus spp.*)、花蜱屬

五、發明說明 (27)

(*Amblyomma* spp.)、璃眼蜱屬(*Hyalomma* spp.)、硬蜱屬(*Ixodes* spp.)、癢蟎屬(*Psoroptes* spp.)、皮恙蟎屬(*Chorioptes* spp.)、疥蟎屬(*Sarcoptes* spp.)、跗線蟎屬(*Tarsonemus* spp.)、苜蓿苔蟎(*Bryobia praetiosa*)、全爪蟎
 5 屬(*Panonychus* spp.)、葉蟎屬(*Tetranychus* spp.)、半跗線蟎屬(*Hemitarsonemus* spp.)、短須蟎屬(*Brevipalpus* spp.)。

植物寄生性線蟲包含，例如，*Pratylenchus* spp.、*Radopholus similis*、*Ditylenchus dipsaci*、柑橘墊刀(*Tylenchulus semipenetrans*)、*Heterodera* spp.、*Globodera*
 10 spp.、*Meloidogyne* spp.、*Aphelenchoides* spp.、*Longidorus* spp.、*Xiphinema* spp.、*Trichodorus* spp.、*Bursaphelenchus* spp.)。

根據本發明，所有植物與部分植物體均可能處理。於本文中，植物意指所有植物與植物族群，例如需要及不需
 15 要之野生植物或收成作物(包括天然存在之收成作物)。收成作物為可利用習知植物育種及最適方法或利用生物技術與遺傳工程或這些方法之組合獲得之植物，包括基因轉移植物及受或不受植物育種者之權利保護之植物品種，例如苗、葉、花及根，可述及之實例為葉、針、柄、莖、花、
 20 果實體、水果、種子、根、結節及根狀莖。部分植物體亦包含經收穫之材料，及無性與有性繁殖材料，例如插枝物、結節、根狀莖、短莖及種子。

根據本發明，單獨以式(I)化合物及特別是以活性化合物組成物處理植物及部分植物體之方法係直接進行或根據

五、發明說明 (²⁸)

習知處理法，例如利用浸漬、噴霧、蒸發、生霧、撒佈、漆上及於繁殖體之情形下，特別是於種子之情形下，進一步利用塗覆一或多次，使作用於其環境、棲息或貯存處。

如上所述，根據本發明，得以處理所有植物及部分植物體。於較佳具體實例中，係處理野生植物及多種植物品種、或利用習知生物育種(例如雜交或原生質體融合)獲得者、及部分植物體。於進一步之較佳具體實例中，則處理利用遺傳工程(適當時，則與習知方法組合)獲得之基因轉移植物及植物品種(基因改造生物)，及部分植物體。「部分」或「部分植物體」等詞已於上文說明。

特佳為，根據本發明處理於各情形下市售可得或使用中之植物品種之植物。

視植物品種、其位置及生長條件(土壤、氣候、植被期、養料)而異，根據本發明之處理亦可能產生超增加(「增效」)之效果。例如，超越實際預期效果之施加率減少及/或殺昆蟲活性譜變廣及/或根據本發明可用之物質及組成物之活性增加、植物生長較佳、對高溫或低溫之耐性增加、對乾旱或對水或土壤鹽含量之耐性增加、花開得多、易於收割、加速成熟、收穫率較高、品質較佳及/或收成產品營養價值較高、貯存安定性及/或收成產品加工性較好等。

根據本發明欲處理及較佳之基因轉移植物或植物品種(亦即以遺傳工程方法獲得者)包含，於基因改造中，得到賦與該等植物特別有利之有用性質(「特性」)的遺傳物質之所有植物。此等性之實例為植物生長較佳、對高溫或低

五、發明說明(29)

- 溫之耐性增加、對乾旱或對水或土壤鹽含量之耐性增加、花開得多、易於收割、加速成熟、收穫率較高、品質較佳及/或收成產品營養價值較高、貯存安定性及/或收成產品加工性較好。此等性質之進一步及特別著重之實例為植物
- 5 對抗動物及微生物害物(例如對抗昆蟲、蟬蟎、植物病原真菌、細菌及/或病毒)之防禦力較佳、以及植物對特定具除草活性化合物之耐性增加。可述及之基因轉移植物之實例為重要收成作物，例如穀類(小麥、稻)、玉米、大豆、馬鈴薯、棉花、油菜及水果作物(蘋果、梨、柑橘類水果及葡
- 10 萄果實)，特別是玉米、大豆、馬鈴薯、棉花及油菜。特別著重之特性為由於在植物中產生毒素，特別是以得自蘇雲金芽孢桿菌(*Bacillus thuringiensis*)之遺傳物質[例如以 CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb 與 CryIF 等基因以及其組成物]
- 15 產生者(下文稱為「Bt 植物」，而使植物對昆蟲之防禦力增加。進一步特別著重之特性為植物對特定具除草活性化合物，例如咪唑啉酮、磺胺脲、嘉磷塞(glyphosate)或次膦酸麥黃酮(例如「PAT」基因)之耐性增加。賦與論及之所需特性之基因亦可互相組合而存在於基因轉移植物中。可述及
- 20 之「Bt 植物」實例為以商品名 YIELD GARD®(例如玉米、棉花、大豆)、KnockOut®(例如玉米)、StarLink®(例如玉米)、Bollgard®(棉花)、Nucotn®(棉花)及 NewLeaf®(馬鈴薯)出售之玉米變種、棉花變種、大豆變種及馬鈴薯變種。可述及之對除草劑具耐性植物之實例為以商品名 Roundup

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (30)

Ready[®](對嘉磷塞之耐性，例如玉米、棉花、大豆)、Liberty Link[®](對次膦醯麥黃酮具耐性，例如油菜)、IMI[®](對咪唑啉酮具耐性)及 STS[®](對磺醯脲具耐性，例如玉米)出售之玉米變種、棉花變種及大豆變種。可述及之對除草劑具耐性之植物(以習知方法針對除草劑耐性育種之植物)包含以商品名 Clearfield[®](例如玉米)出售之變種。當然，這些敘述亦可應用於具有此等特性或仍待開發之遺傳特性之植物變種，該等植物未來將開發及/或上市。

所列植物可以特別有利之方法，使用根據本發明之活性化合物混合物，根據本發明予以處理。上述混合物之較佳範圍亦可應用於該等植物之處理。特別著重於以本文詳述之混合物進行植物之處理。

所用式(I)化合物與式(II)化合物之比率及混合物總量，視昆蟲的性質與發生而定。每次施用時，最適使用比率及總量於各情形下以試驗系列予以決定。通常，式(I)化合物對式(II)化合物之比率為 1:100 至 100:1，較佳為 1:25 至 25:1，特佳為 1:5 至 5:1，以上所述為重量比。

活性化合物組成物可轉化成習知調配物例如溶液、乳液、可濕性粉劑、懸浮液、粉劑、粉塵、糊劑、可溶性粉劑、粒劑、懸浮液-乳液濃縮物、以活性化合物浸漬之天然及合成物料、及於聚合物料中予以微膠囊化。

彼等調配物係以已知方法製造，例如將活性化合物與填充劑(亦即，液體溶劑及/或固體載劑)混合，及視需要使用界面活性劑(亦即，乳化劑及/或分散劑)及/或泡沫形成

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂

五、發明說明 (³¹)

劑。

若所用填充劑為水，則亦可，例如，使用有機溶劑作用共同溶劑。本質上適宜之液體溶劑為：芳族烴例如二甲苯、甲苯或烷基萘，氯化芳族烴及氯化脂族烴例如氯苯類、
5 氯乙烯類或二氯甲烷，脂族烴例如環己烷或鏈烷烴，例如無機油餾分、無機及植物油、醇例如丁醇或乙二醇及其醚和酯，酮例如丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁基酮或環己酮，強極性溶劑例如二甲基甲醯胺及二甲亞砷，或者水。

- 適宜之固體載劑：舉例而言，銨鹽及細磨之天然礦物
10 例如高嶺土、黏土、滑石粉、白堊、石英、綠坡縷石、蒙脫土或矽藻土、及細磨之合成物料例如高度分散之矽石、氧化鋁及矽酸鹽；用於粒劑之適宜固體載劑：舉例而言，經壓碎與分級之天然岩石例如方解石、大理石、浮石、海
15 泡石及白雲石，或者合成之無機與有機粗粉之合成粒劑，及有機物料例如鋸屑、椰殼、玉米穗及煙草稈之粒劑；適宜之乳化劑及/或泡沫形成劑：舉例而言，非離子性及陰離子性乳化劑例如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚，例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸酯、烷基硫酸酯、芳
20 基磺酸酯、或蛋白質水解物；適宜之分散劑為：例如木質素-亞硫酸鹽廢液及甲基纖維素。

調配物中可使用增黏劑例如羧甲基纖維素及呈粉劑、粒劑或膠乳形式之天然及合成聚合物，例如阿拉伯膠、聚
25 乙烯醇及聚乙酸乙烯酯，或天然磷脂例如腦磷脂與卵磷脂，及合成磷脂。其他添加劑可為礦物及植物油。

五、發明說明（³²）

亦可使用著色劑例如無機色素，例如氧化鐵、氧化鈦與普魯士藍，及有機著色劑例如茜素色料、偶氮色料與金屬酞菁色料，及微量營養素例如鐵、錳、硼、銅、鈷、鉬與鋅等鹽。

- 5 調配物通常含有 0.1 至 95% 重量比，較佳為 0.5 至 90% 重量比之活性化合物。

- 根據本發明之活性化合物組成物可呈其市售可得調配物，及以這些調配物與其他活性化合物(例如殺昆蟲劑、引誘劑、消毒劑、殺細菌劑、殺蟎劑、殺線蟲劑、殺真菌劑、
10 生長調節物質或除草劑)混合製成使用形式存在。殺昆蟲劑包含，例如，磷酸鹽、胺基甲酸鹽、羧酸鹽、氯化烴、苯基脲及由微生物產生之物質。

適宜之混合成分實例如下：

殺真菌劑：

- 15 阿敵莫(aldimorph)、安普洛松(ampropylfos)、安普洛松鉀、安多林(andoprim)、安尼拉新(anilazine)、氮雜克座(azaconazole)、亞佐賓(azoxystrobin)、

- 貝那西(benalaxyl)、倍達寧(benodanil)、免賴得(benomyl)、倍雜麻利(benzamacril)、異丁基倍雜麻利、必
20 拉松(bialaphos)、秉那帕(binapacryl)、聯二苯、比多農(bitertanol)、保米黴素(blasticidin-S)、溴克座(bromuconazole)、布瑞莫(bupirimate)、得滅多(buthiobate)、

多硫化鈣、蓋西黴素(capsimycin)、四氯丹(captafol)、蓋普丹(captan)、貝芬替(carbendazim)、加保新(carboxin)、

五、發明說明（³³）

克逢(carvon)、喹啉甲二磺酸酯、克氯塞松(chlobenthiazole)、克芬座(chlorfenazole)、克洛內(chloroneb)、克洛必寧(chloropicrin)、四氯異苯(chlorothalonil)、克座利內(chlozolate)、克濟康
5 (clozylacon)、卡蘭內(cufraneb)、克絕(cymoxanil)、賽洛克座(cyproconazole)、賽普洛(cyprodinil)、賽普蘭(cyprofuram)、

第貝卡(debacarb)、二氯芬(dichlorophen)、大克座(diclobutrazole)、益發靈(diclofluanid)、大滅淨
10 (diclomezine)、大克爛(dicloran)、大索克(diethofencarb)、待克利(difenoconazole)、敵滅莫(dimethirimol)、達滅芬(dimethomorph)、達克利(diniconazole)、達克利-M、白粉克(dinocap)、二苯胺、地匹松(dipyrithione)、普得松(ditalimfos)、腈硫琨(dithianon)、多敵莫(dodemorph)、多
15 寧(dodine)、抓座隆(drazoxolon)、

護粒松(edifenphos)、依普座(epoxiconazole)、益他座(etaconazole)、依瑞莫(ethirimol)、依得利(etridiazole)、

飛莫冬(famoxadon)、芬帕尼(fenapanil)、芬瑞莫(fenarimol)、芬佈座(fenbuconazole)、芬福爛(fenfuram)、
20 芬尼潘(fenitropan)、芬皮寧(fenpiclonil)、芬撲定(fenpropidin)、芬普福(fenpropimorph)、三苯醋錫(fentin acetate)、三苯羥錫(fentin hydroxide)、富爾邦(ferbam)、飛林松(ferimzone)、扶吉胺(flauzinam)、護美福(flumetover)、福洛邁(fluoromide)、護康座(fluquinconazole)、護密多

五、發明說明（ 34 ）

(flurprimidol)、護矽得(flusilazole)、護沙邁(flusulfamide)、
福多寧(flutolanil)、護三福(flutriafol)、福爾培(folpet)、鋁
福賽得(fosetyl-Al)、鈉福賽得、熱必斯(fthalide)、福達座

5 護卡寧(furcarbonil)、福康座(furconazole)、順式福康座、
福美洛(furmecyclox)、

克熱淨(guazatine)、

六氯苯、菲克利(hexaconazole)、殺紋寧(hymexazole)、

依滅列(imazalil)、依本康座(imibenconazole)、亞胺辛

10 丁(iminoctadine)、阿爾貝酸亞胺辛丁(iminoctadine
albesilate)、三乙酸亞胺辛丁(iminoctadine triacetate)、碘
克(iodocarb)、依康座(ipconazole)、丙基喜樂松(iprobenfos)
(IBP)、依普同(iprodione)、依魯黴素(irumamycin)、亞賜圃
(isoprothiolane)、依瓦同(isovaledione)、

15 嘉賜黴素(kasugamycin)、甲基瑞索新
(kresoxim-methyl)、銅製劑例如氫氧化銅、環己烷甲酸銅、
氧基氯化銅、硫酸銅、氧化銅、快得寧(oxine-copper)及
Bordeaux 混合物、

20 錳銅(mancopper)、鋅錳乃浦(mancozeb)、錳乃浦
(maneb)、美福松(meferimzone)、滅潘寧(mepanipyrin)、滅
普寧(mepronil)、滅達樂(metalaxyl)、滅康座(metconazole)、
滅殺克(methasulfocarb)、美福洛(methfuroxam)、免得爛
(metiram)、美多蘭(metomeclam)、滅殺瓦(metsulfovax)、
滅敵黴素(mildiomycin)、邁克尼(myclobutanil)、邁克林

五、發明說明 (35)

(myclozolin)、

二 甲 基 二 硫 代 胺 基 甲 酸 鎳、異 丙 硝 殺
(nitrothal-isopropyl)、尼 瑞 莫(nuarimol)、

歐 福 瑞 (ofurace)、毆 殺 斯 (oxadixyl)、歐 殺 克
5 (oxamocarb)、唑 利 酸 (oxolinic acid)、嘉 保 信
(oxycarboxim)、芬 喜 辛(oxyfenthiin)、

巴 克 素(paclobutrazole)、佩 福 座(pefurazoate)、平 克 座
(penconazole)、賓 克 隆(pencycuron)、福 敵 芬(phosdiphen)、
比 美 辛 (pimaricin)、哌 拉 林 (piperalin)、保 力 黴 素
10 (polyoxin)、保 力 寧(polyoxorim)、普 本 康 座(probenazole)、
撲 克 拉 (prochloraz)、撲 滅 寧 (procymidone)、普 拔 克
(propamocarb)、鈉 丙 烷 辛 (propanosine-sodium)、普 克 利
(propiconazole)、甲 基 鋅 乃 浦 (propineb)、白 粉 松
(pyrazophos)、比 芬 諾 (pyrifenox)、必 美 寧 (pyrimethanil)、
15 百 快 隆 (pyroquilon)、必 喜 福 (pyroxyfur)、

快 康 座 (quinconazole)、快 多 真 (quintozene) (PCNB)、
硫 及 硫 製 劑、

得 克 利 (tebuconazole)、得 洛 爛 (tecloftalam)、得 那 真
(tecnazene)、得 賽 西 (tetcyclacis)、四 康 座 (tetraconazole)、
20 腐 絕 (thiabendazole)、賜 塞 芬 (thicyofen)、賜 福 邁
(thifluzamide)、甲 基 多 保 淨 (thiophanate-methyl)、得 恩 地
(thiram)、地 喜 密 (tioxyimid)、甲 基 多 樂 松
(tolclofos-methyl)、多 利 寧 (tolylfluanid)、三 泰 芬
(triadimefon)、三 泰 隆 (triadimenol)、三 佈 敵 (triazbutil)、

五、發明說明 (36)

三落賽(triazoxide)、三拉邁(trichlamide)、三賽唑(tricyclazole)、三得芬(tridemorph)、賽福座(triflumizole)、賽福寧(triforine)、敵康座(triticonazole)、

單康座(uniconazole)、

5 華利達黴素 A(validamycin A)、免克寧(vinclozolin)、維康座(viniconazole)、

殺拉邁(zarlamide)、鋅乃浦(zineb)、濟爛(ziram)以及 Dagger G、

OK-8705、

10 OK-8801、

α -(1,1-二甲基乙基)- β -(2-苯氧乙基)-1H-1,2,4-三唑-1-乙醇、

α -(2,4-二氯苯基)- β -氟- β -丙基-1H-1,2,4-三唑-1-乙醇、

15 α -(2,4-二氯苯基)- β -甲氧基- α -甲基-1H-1,2,4-三唑-1-乙醇、

α -(5-甲基-1,3-二噁烷-5-基)- β -[[4-(三氟甲基)-苯基]伸甲基]-1H-1,2,4-三唑-1-乙醇、

(5RS,6RS)-6-羥基-2,2,7,7-四甲基-5-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-3-辛酮、

(E)- α -(甲氧亞胺基)-N-甲基-2-苯氧基-苯基乙醯胺、

{2-甲基-1-[[[1-(4-甲基苯基)-乙基]-胺基]-羰基]-丙基}-胺甲酸 1-異丙酯、

1-(2,4-二氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-乙酮 O-(苯

五、發明說明 (37)

基甲基)-肟、

1-(2-甲基-1-萘基)-1H-吡咯-2,5-二酮、

1-(3,5-二氯苯基)-3-(2-丙烯基)-2,5-吡咯啉二酮、

1-[(二碘甲基)-磺醯基]-4-甲基-苯、

5 1-[[2-(2,4-二氯苯基)-1,3-二噁環戊烷-2-基]-甲基]-1H-咪唑、

1-[[2-(4-氯苯基)-3-苯基環氧乙烷基]-甲基]-1H-1,2,4-三唑、

10 1-[1-[2-[(2,4-二氯苯基)-甲氧基]-苯基]-乙烯基]-1H-咪唑、

1-甲基-5-壬基-2-(苯基甲基)-3-吡咯啉醇、

2',6'-二溴-2-甲基-4'-三氟甲氧基-4'-三氟甲基-1,3-噻唑-5-甲醯替苯胺、

15 2,2-二氯-N-[1-(4-氯苯基)-乙基]-1-乙基-3-甲基-環丙烷甲醯胺、

2,6-二氯-5-(甲硫基)-4-嘧啶基-硫氰酸酯、

2,6-二氯-N-(4-三氟甲基苄基)-苯甲醯胺、

2,6-二氯-N-[[4-(三氟甲基)-苯基]-甲基]-苯甲醯胺、

2-(2,3,3-三碘-2-丙烯基)-2H-四唑、

20 2-[(1-甲基乙基)-磺醯基]-5-(三氟甲基)-1,3,4-噻二唑、

2-[[6-脫氧-4-O-(4-O-甲基-β-D-糖吡喃糖基)-α-D-葡萄糖吡喃糖基]-胺基]-4-甲氧基-1H-吡咯并[2,3-d]嘧啶-5-甲腈、

2-胺基丁烷、

五、發明說明 (38)

2-溴-2-(溴甲基)-戊二腈、

2-氯-N-(2,3-二氫-1,1,3-三甲基-1H-茛-4-基)-3-吡啶甲
醯胺、

2-氯-N-(2,6-二甲基苯基)-N-(異氰硫基甲基)-乙醯胺、

5 2-苯基苯酚(OPP)、

3,4-二氯-1-[4-(二氟甲氧基)-苯基]-1H-吡咯-2,5-二酮、

3,5-二氯-N-[氰基[(1-甲基-2-丙炔基)-氧基]-甲基]-苯甲
醯胺、

3-(1,1-二甲基丙基)-1-酮基-1H-茛-2-甲腈、

10 3-[2-(4-氯苯基)-5-乙氧基-3-異噁唑啉基]-吡啶、

4-氯-2-氰基-N,N-二甲基-5-(4-甲基苯基)-1H-咪唑-1-
磺醯胺、

4-甲基-四唑并[1,5-a]喹唑啉-5(4H)-酮、

8-(1,1-二甲基乙基)-N-乙基-N-丙基-1,4-二噁螺[4.5]

15 癸烷-2-甲胺、

8-羥基喹啉硫酸鹽、

9H-黃嘌呤素-2-[(苯胺基)-羰基]-9-羧酸醯肼、

雙-(1-甲基乙基)-3-甲基-4-[(3-甲基苄醯基)-氧
基]-2,5-噁吩二羧酸酯、

20 順式-1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-環庚醇、

順式-4-[3-[4-(1,1-二甲基丙基)-苯基-2-甲基丙基]-2,6-
二甲基-嗎啉鹽酸鹽、

[(4-氯苯基)-偶氮]-氰基乙酸乙酯、

碳酸氫鉀、

五、發明說明 (39)

甲烷四硫醇鈉鹽、

1-(2,3-二氫-2,2-二甲基-1H-茛-1-基)-1H-咪唑-5-羧酸
甲酯、

N-(2,6-二甲基苯基)-N-(5-異噁唑基羰基)-DL-丙胺酸
5 甲酯、

N-(氯乙醯基)-N-(2,6-二甲基苯基)-DL-丙胺酸甲酯、

N-(2,3-二氯-4-羥苯基)-1-甲基-環己烷甲醯胺、

N-(2,6-二甲基苯基)-2-甲氧基-N-(四氫-2-酮基-3-呋喃
基)-乙醯胺、

10 N-(2,6-二甲基苯基)-2-甲氧基-N-(四氫-2-酮基-3-噻吩
基)-乙醯胺、

N-(2-氯-4-硝苯基)-4-甲基-3-硝基-苯磺醯胺、

N-(4-環己基苯基)-1,4,5,6-四氫-2-嘧啶胺、

N-(4-己基苯基)-1,4,5,6-四氫-2-嘧啶胺、

15 N-(5-氯-2-甲基苯基)-2-甲氧基-N-(2-酮基-3-噁唑啉
基)-乙醯胺、

N-(6-甲氧基-3-吡啶基)-環丙烷甲醯胺、

N-[2,2,2-三氯-1-[(氯乙醯基)-胺基]-乙基]-苯甲醯胺、

N-[3-氯-4,5-雙-(2-丙醯氧基)-苯基]-N'-甲氧基-甲基
20 亞胺醯胺、

N-甲醯基-N-羥基-DL-丙胺酸-鈉鹽、

[2-(二丙胺基)-2-酮乙基]-乙基硫代磷醯胺酸 O,O-二
乙酯、

O-甲基 S-苯基苯丙基硫代磷醯胺酸酯、

五、發明說明 (40)

1,2,3-苯并噻二唑-7-硫代羧酸 S-甲酯、

螺[2H]-1-苯并吡喃-2,1'(3'H)-異苯并呋喃]-3'-酮；

殺細菌劑：

佈諾普 (bronopol)、二氯芬 (dichlorophen)、耐措寧
5 (nitrapyrin)、二甲基二硫代胺基甲酸鎳、嘉賜黴素、歐西
農 (octhilinone)、呋喃羧酸、氧基甲環黴素、普本康座、鏈
黴素、敵洛爛 (tecloftalam)、硫酸銅及其他銅製劑；

殺昆蟲劑/殺蟎劑/殺線蟲劑：

阿巴汀 (abamectin)、歐殺松 (acephate)、醋密普利
10 (acetamiprid)、亞那寧 (acrinathrin)、亞拉克 (alanycarb)、得
滅克 (aldicarb)、亞喜克 (aldoxycarb)、 α -賽滅寧、亞發寧
(alphamethrin)、三亞蟎 (amitraz)、亞滅停 (avermectin)、AZ
60541、雜拉錫 (azadirachtin)、雜美松 (azamethiphos0)、谷
速松 A (azinphos A)、谷速松 M (azinphos M)、亞環錫
15 (azocyclotin)、

日本甲蟲桿菌 (*Bacillus popilliae*)、球形桿菌 (*Bacillus*
sphaericus)、枯草桿菌 (*Bacillus popilliae*)、蘇力桿菌
(*Bacillus thuringiensis*)、桿狀病毒、白僵菌 (*Beauveria*
bassiana)、纖細白僵菌 (*Beauveria tenella*)、免敵克
20 (bendiocarb)、免扶克 (benfuracarb)、免速達 (bensultap)、
西脫蟎 (benzoximate)、貝它賽扶寧 (betacyfluthrin)、必芬那
(bifenazate)、畢芬寧 (bifenthrin)、拜殺滅寧
(bioethanomethrin)、拜帕滅寧 (biopermethrin)、BPMC、溴
磷松 A (bromophos A)、必克蟲 (bufencarb)、布芬淨

五、發明說明 (41)

(buprofezin)、布硫松(butathiofos)、佈嘉信(butocarboxim)、
丁吡本(butylpyridaben)、

卡杜松(cadusfos)、加保利(carbaryl)、加保扶
(carbofuran)、加芬松(carbophenothion)、丁基加保扶
5 (carbosulfan)、培丹(cartap)、氯索克(chloethocarb)、氯乙
氧松(chlorethoxyfos)、氯芬拜(chlofenapyr)、氯芬松
(chlorfenvinphos)、克福隆(chlorfluazuron)、克美松
(chlormephos)、陶斯松(chlorpyrifos)、陶斯松 M、克瓦寧
(chlovaporthrin)、順式瑞美寧(cis-resmethrin)、西帕美寧
10 (cispermethrin)、克洛賽寧(clocythrín)、克洛索克
(cloethocarb)、克芬蟎(clofentezine)、施力松(cyanophos)、
環普寧(cycloprene)、環普洛寧(cycloprothrin)、賽扶寧
(cyfluthrin)、賽鹵寧(cyhalothrin)、錫蟎丹(cyhexatin)、賽
滅寧(cypermethrin)、賽滅淨(cyromazine)、

15 第滅寧(deltamethrin)、滅賜松 M(demeton M)、滅賜松
S、甲基滅賜松、肽芬隆(diafenthiuron)、大利松(diazinon)、
二氯松(dichlorvos)、二福隆(diflubenzuron)、大滅松
(dimethoat)、二甲基芬松(dimethylvinphos)、二芬爛
(diofenolan)、二硫松(disulfoton)、多克殺鈉
20 (docusat-sodium)、多芬潘(dofenapyn)、

益福矽(eflusalate)、益滅停(emamectin)、安潘寧
(empenthrin)、安殺番(endosulfan)、蟲黴屬(*Entomophthora*
spp.)、益化利(esfenvalerate)、愛殺克(ethiofencarb)、愛殺
松(ethion)、普伏松(ethoprophos)、益多芬洛(etofenprox)、

五、發明說明（ 42 ）

益多康座(etoxazole)、益多松(etrimfos)、

芬滅松(fenamiphos)、芬殺蟎(fenazaquin)、芬佈賜
(fenbutatin oxide)、撲滅松(fenitrothion)、芬硫克
(fenothiocarb)、芬殺寧(fenoxacrim)、芬諾克(fenoxycarb)、

5 芬普寧(fenpropathrin)、芬普拉(fenpyrad)、芬拜寧
(fenpyrithrin)、芬普(fenpyroximate)、芬化利(fenvalerate)、

芬普尼(fipronil)、扶吉胺(flauzinam)、扶助隆(flauzuron)、

護溴賽寧(flubrocylthrinat)、福賽隆(flucylcoxuron)、護賽

寧(flucylthrinat)、福芬隆(flufenoxuron)、福添淨

10 (flutenzine)、福利松(flualinate)、大福松(fonophos)、松

美爛(fosmethilan)、松賽殺(fosthiazate)、護芬洛

(fubfenprox)、護拉克(furathiocarb)、

顆粒性病毒、

鹵芬賽(halofenzide)、HCH、飛達松(heptenophos)、六

15 伏隆(hexaflumuron)、合賽多(hexythiazox)、氫普寧

(hydroprene)、

益達胺(imidacloprid)、依殺松(isazofos)、亞芬松

(isofenphos)、加福松(isoxathion)、愛滅停(ivermectin)、

核多面體病毒、

20 λ-賽鹵寧、路芬隆(lufenuron)、

馬拉松、滅加松(mecarbam)、滅達害(metaldehyde)、

達馬松(methamidophos)、*Metharhizium anisopliae*、

Metharhizium flavoviride、滅大松(methidathion)、滅賜克

(methiocarb)、納乃得(methomyl)、甲氧芬賽

五、發明說明 (43)

(methoxyfenozide)、治滅蟲 (metolcarb)、滅多松 (metoxadiazone)、美文松 (mevinphos)、密貝停 (milbemectin)、亞素靈 (monocrotophos)、

那列 (naled)、尼天爛 (nitenpyram)、尼賽淨
5 (nithiazine)、諾瓦隆 (novaluron)、

歐滅松、歐殺滅 (oxamyl)、滅多松 (oxydemethon M)、

玫 色擬青黴 (*Paecilomyces fumosoroseus*)、巴拉松
A、巴拉松 M、百滅寧 (permethrin)、賽達松 (phenthoat)、
福瑞松 (phorat)、裕必松 (phosalone)、益滅松 (phosmet)、福
10 賜米松 (phosphamidon)、巴賽松 (phoxim)、比加普
(pirimicarb)、亞特松 A (pirimiphos A)、亞特松 M、佈飛松
(profenofos)、普滅克 (promecarb)、安丹 (propoxur)、普硫
松 (prothiofos)、飛克松 (prothoat)、拜滅淨 (pymetrozine)、
白克松 (pyraclofos)、拜滅寧 (pyresmethrin)、除蟲菊精
15 (pyrethrum)、畢達本 (pyridaben)、畢達松 (pyridathion)、畢
米芬 (pyrimidifen)、百西芬 (pyriproxyfen)、

拜裕松 (quinalphos)、

瑞巴寧 (ribavirin)、

沙利硫 (salithion)、西布松 (sebufos)、西拉福芬
20 (silafluofen)、賓諾沙 (spinosad)、硫帖 (sulfotep)、沙洛松
(sulprofos)、

τ - 福利松、得芬諾 (tebufenozide)、得芬拜
(tebufenpyrad)、得寧松 (tebupirimiphos)、得福隆
(teflubenzuron)、得福寧 (tefluthrin)、得美松 (temephos)、

五、發明說明（⁴⁴）

- 得密松 (temivinhos)、托福松 (terbufos)、樂本松 (tetrachlorvinphos)、 θ -賽滅寧、賽美索佔 (thiamethoxam)、賽普洛寧 (thiapronil)、賽三松 (thiatriphos)、硫賜安草酸氫鹽、硫敵克 (thiodicarb)、硫化隆 (thiofanox)、蘇雲金素 (thuringiensin)、泰賽寧 (tralocythrin)、泰滅寧 (tralomethrin)、三拉森 (triarathene)、三雜滅 (triazamate)、三落松 (triazophos)、三祖隆 (triazuron)、三氯芬啶 (trichlophenidine)、三氯松 (trichlorfon)、三福隆 (triflumuron)、三美克 (trimethacarb)、
- 10 繁米松 (vamidothion)、繁尼洛 (vaniliprole)、輪枝孢屬之 *Verticillium lecanii*、
- YI 5302、
- ζ -賽滅寧、周拉松 (zolaprofos)、
- (1R-順式)-[5-(苯基甲基)-3-呋喃基]-甲基-3-[(二氫-2-酮基-3(2H)-亞呋喃基)-甲基]-2,2-二甲基環丙烷羧酸酯、
- 15 (3-苯氧苯基)-甲基-2,2,3,3-四甲基環丙烷羧酸酯、
- 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]四氫-3,5-二甲基-N-硝基-1,3,5-三吡-2(1H)-亞胺、
- 2-(2-氯-6-氟苯基)-4-[4-(1,1-二甲基乙基)苯基]-4,5-二
- 20 氫-噁唑、
- 2-(乙醯氧基)-3-十二基-1,4-萘二酮、
- 2-氯-N-[[[4-(1-苯基乙氧基)-苯基]-胺基]-羰基]-苯甲醯胺、
- 2-氯-N-[[[4-(2,2-二氯-1,1-二氟乙氧基)-苯基]-胺基]-

五、發明說明（⁴⁵）

羰基]-苯甲醯胺、

丙基胺基甲酸 3-甲基苯酯、

4-[4-(4-乙氧苯基)-4-甲基戊基]-1-氟-2-苯氧基-苯、

4-氯-2-(1,1-二甲基乙基)-5-[[2-(2,6-二甲基-4-苯氧基
5 氧基)乙基]硫基]-3(2H)-吡啶酮、

4-氯-2-(2-氯-2-甲基丙基)-5-[(6-碘-3-吡啶基)甲氧基]-3(2H)-吡啶酮、

4-氯-5-[(6-氯-3-吡啶基)甲氧基]-2-(3,4-二氯苯基)-3(2H)-吡啶酮、

10 蘇雲金芽孢桿菌菌株 EG-2348、

[2-苄醯基-1-(1,1-二甲基乙基)-胼基苯甲酸、

丁酸 2,2-二甲基-3-(2,4-二氯苯基)-2-酮基-1-氧雜螺
[4.5]癸-3-烯-4-酯、

[3-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-亞噻唑啉基]-氟胺、

15 二氫-2-(硝基亞甲基)-2H-1,3-噻吡-3(4H)-甲醛、

[2-[[1,6-二氫-6-酮基-1-(苯基甲基)-4-吡啶基]氧基]乙基]-胺基甲酸乙酯、

N-(3,4,4-三氟-1-酮基-3-丁烯基)-甘胺酸、

N-(4-氯苯基)-3-[4-(二氟甲氧基)苯基]-4,5-二氫-4-苯
20 基-1H-吡啶-1-甲醯胺、

N-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-N'-甲基-N''-硝基-胍、

N-甲基-N'-(1-甲基-2-丙烯基)-1,2-胼二羧硫代醯胺、

N-甲基-N'-2-丙烯基-1,2-胼二羧硫代醯胺、

[2-(二丙胺基)-2-酮乙基]-乙基硫代磷醯胺酸 O,O-二

五、發明說明（⁴⁶）

乙酯。

亦可為與其他已知活性化合物(例如除草劑)或與肥料及生長調節劑之混合物。

作為殺昆蟲劑用時，可使根據本發明之活性化合物組成進一步呈其市售可得調配物，及以這些調配物與增效劑混合製成使用形式存在。增效劑為增加活性化合物之作用，而本身不需要具有活性之化合物。

以市售可得調配物製備的使用形式中，活性化合物含量可於寬廣範圍內有所不同。使用形式之活性化合物濃度可為 0.0000001 至 95%，較佳為 0.0001 至 1%重量比之活性化合物。

化合物係以對使用形式適當之習知方法予以施用。

用於對抗保健害物及貯存產品害物時，活性化合物組成物之特徵為在木頭及黏土上之殘留作用極佳，以及對石灰化基質上之鹼具良好之穩定性。

根據本發明之活性化合物不僅對植物害物、保健害物及貯存產品害物具活性，同時，可於獸醫領域中對抗動物寄生物(外寄生物)例如硬蜱、軟蜱、疥蟎、秋收恙蟎、蠅(螫刺及舔舐性)、寄生性蠅幼蟲、虱、頭虱、烏虱及蚤。這些寄生物包含：

屬於虱目(Anoplurida)者，例如獸虱屬(*Haematopinus spp.*)、長顎虱屬(*Linognathus spp.*)、虱屬(*Pediculus spp.*)、*Phtirus spp.*、*Solenopotes spp.*。

屬於食毛目(Mallophagida)及鈍角(Amblycerina)與細

五、發明說明 (47)

角亞目 (Ischnocerina) 者，例如，毛鳥虱屬 (*Trimenopon* spp.)、短角鳥虱屬 (*Menopon* spp.)、巨毛虱屬 (*Trinoton* spp.)、羽虱屬 (*Bovicola* spp.)、*Werneckiella* spp.、*Lepikentron* spp.、*Damalina* spp.、獸鳥虱屬 (*Trichodectes* spp.)、羽虱屬 (*Felicola* spp.)。

屬於雙翅目及長角 (Nematocerina) 與短角亞目 (Brachyocerina) 者，例如，伊蚊屬 (*Aedes* spp.)、按蚊屬 (*Anopheles* spp.)、庫蚊屬 (*Culex* spp.)、蚋蠅屬 (*Simulium* spp.)、*Eusimulium* spp.、糠蚊屬 (*Phlebotomus* spp.)、*Lutzomyia* spp.、蚊屬 (*Culicoides* spp.)、草蛉屬 (*Chrysops* spp.)、*Hybomitra* spp.、*Atylotus* spp.、牛虻屬 (*Tabanus* spp.)、*Haematopota* spp.、*Philipomyia* spp.、*Braula* spp.、家蠅屬 (*Musca* spp.)、*Hydrotaea* spp.、螫蠅屬 (*Stomoxys* spp.)、盲蜉屬 (*Haematobia* spp.)、*Morellia* spp.、廢蠅屬 (*Fannia* spp.)、舌蠅屬 (*Glossina* spp.)、麗蠅屬 (*Calliphora* spp.)、綠蠅屬 (*Lucilia* spp.)、*Chrysomyia* spp.、*Wohlfahrtia* spp.、麻蠅屬 (*Sarcophaga* spp.)、狂蠅屬 (*Oestrus* spp.)、皮蠅屬 (*Hypoderma* spp.)、胃蠅屬 (*Gastrophilus* spp.)、虱蠅屬 (*Hippobosca* spp.)、*Lipoptena* spp.、虱蠅屬 (*Melophagus* spp.)。

屬於蚤目者，例如，蚤屬 (*Pulex* spp.)、頭蚤屬 (*Ctenocephalides* spp.)、鼠蚤屬 (*Xenopsylla* spp.)、蚤屬 (*Ceratophyllus* spp.)。

屬於異翅亞目者，例如，臭蟲屬 (*Cimex* spp.)、獵蝽屬

五、發明說明（ 48 ）

(*Triatoma spp.*)、*Rhodnius spp.*、*Panstrongylus spp.*。

屬於蜚蠊目者，例如，東方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、美洲大蠊(*Periplaneta americana*)、德國小蠊(*Blattella germanica*)、蜚蠊屬(*Supella spp.*)。

- 5 屬於蜱蟎亞綱及後胸-與中胸氣門目者，例如，隱喙蜱屬(*Argas spp.*)、鈍喙蜱屬(*Ornithodoros spp.*)、殘喙蜱屬(*Otobius spp.*)、硬蜱屬(*Ixodes spp.*)、花蜱屬(*Amblyomma spp.*)、蜱屬(*Boophilus spp.*)、革蜱屬(*Dermacentor spp.*)、*Haemophysalis spp.*、璃眼蜱屬(*Hyalomma spp.*)、扇頭蜱屬
- 10 (*Rhipicephalus spp.*)、刺蟎屬(*Dermanyssus spp.*)、*Railletia spp.*、*Pneumonyssus spp.*、*Sternostoma spp.*、*Varroa spp.*。

- 屬於 Actinedida(Prostigmata)與 Acaridida(Astigmata)目者，例如，*Acarapis spp.*、*Cheyletiella spp.*、*Ornithocheyletia spp.*、*Myobia spp.*、*Psorergates spp.*、蠕
- 15 形蟎屬(*Demodex spp.*)、恙蟎屬(*Trombicula spp.*)、*Listrophorus spp.*、粉蟎屬(*Acarus spp.*)、酪蟎屬(*Tyrophagus spp.*)、*Caloglyphus spp.*、*Hypodectes spp.*、*Pterolichus spp.*、癢蟎屬(*Psoroptes spp.*)、皮恙蟎屬(*Chorioptes spp.*)、疥蟎屬(*Sarcoptes spp.*)、*Notoedres spp.*、疥蟎屬
- 20 (*Knemidocoptes spp.*)、*Cytodites spp.*、*Laminosioptes spp.*。

根據本發明之活性化合物組成亦適用於防治侵襲農業家畜之節肢動物，該等家畜舉例而言，如，牛、綿羊、山羊、馬、豬、驢、駱駝、水牛、兔、雞、火雞、鴨、鵝、蜜蜂、其他家畜例如狗、貓、籠中鳥、蓄養魚及所謂實驗

五、發明說明 (49)

動物，例如倉鼠、天竺鼠、大鼠及小鼠。藉由防治節肢動物，可使該等家畜之死亡及肉、乳、毛、獸皮、蛋、蜂蜜等生產減縮之情形減少，因此使用根據本發明之活性化合物組成物，使更經濟及簡易之動物飼養成為可能。

- 5 根據本發明之活性化合物組成可以已知方式於獸醫領域中使用：舉例而言，呈例如錠劑、膠囊、飲劑、獸用藥水、粒劑、糊劑、大丸劑、餵飼法、栓劑之形式經腸投予；利用(肌內、皮下、靜脈內、腹膜內等)注射、灌輸非經腸投予；經鼻投予；呈例如浸漬或浸泡、噴霧、澆注、點上、
- 10 沖洗、撒粉、及藉助於含活性化合物之模製用品例如項圈、耳籤、尾籤、四肢繫帶、韁繩、標記裝置等形式經皮投予。

用於牛、家禽、家畜動物等時，活性化合物可呈活性化合物含量為 1 至 80 重量%之調配物，直接或於稀釋 100 至 10,000 倍後施用，或者呈化學滴劑施用。

- 15 此外，亦發現根據本發明之活性化合物組成物對於破壞工業物料的昆蟲具有強效之殺昆蟲作用。

下文列舉可述及昆蟲之較佳實例，惟該等實例不在此限：

- 甲蟲例如：家天牛 (*Hylotrupes bajulus*)、毛天牛
- 20 (*Chlorophorus pilosis*)、家具竊蠹 (*Anobium punctatum*)、*Xestobium rufovillosum*、*Ptilinus pecticornis*、*Dendrobium pertinex*、*Ernobius mollis*、*Priobium carpini*、歐洲竹粉蠹 (*Lyctus brunneus*)、非洲粉蠹 (*Lyctus africanus*)、平頸粉蠹 (*Lyctus planicollis*)、濃毛粉蠹 (*Lyctus pubescens*)、

五、發明說明 (50)

Trogoxylon aequale、*Minthes rugicollis*、小蠹屬(*Xyleborus spp.*)、小蠹屬(*Trypodendron spp.*)、*Apate monachus*、長蠹屬之 *Bostrychus capucins*、*Heterobostrychus brunneus*、*Sinoxylon spp.*、竹長蠹(*Dinoderus minutus*)；

- 5 屬於革翅目者，例如：鋼青小樹蜂(*Sirex juvencus*)、大樹蜂屬之 *Urocerus gigas*、*Urocerus gigas taignus*、*Urocerus augur*；

- 白蟻例如：木白蟻屬之 *Kaloterme flavicollis*、*Cryptoterme brevis*、*Heteroterme indicola*、黃胸散白蟻
10 (*Reticuliterme flavipes*)、*Reticuliterme santonensis*、*Reticuliterme lucifugus*、澳洲白蟻 (*Mastoterme darwiniensis*)、古白蟻屬之 *Zootermopsis nevadensis*、臺灣家白蟻(*Coptoterme formosanus*)；

剛毛尾，例如：西洋衣魚(*Lepisma saccharina*)。

- 15 於本說明書中，工業物料意指無生命之物料例如，較佳為，聚合物、黏合劑、膠黏物、紙與板、皮革、木頭、原木產品及漆料。

欲保護不受昆蟲侵襲之物料特別以木頭及原木產品為佳。

- 20 可由根據本發明組成物或含其之混合物保護的木頭及原木產品乃意指，例如：建築原木、木樑、軌道枕木、橋樑構件、建築物突出部、木製交通工具、盒子、輸送臺、容器、電線桿、木頭被覆物、木窗及木門、三夾板、切削板、細木工製品、或常用於居家建築或建造細木工製品之

五、發明說明（⁵¹）

原木製品。

活性化合物組成物可就這樣使用，或呈濃縮物或一般習知調配物（例如粉劑、粒劑、溶液、懸浮液、乳液或糊劑）之形式使用。

- 5 上述調配物可以本質上已知之方式予以製備，例如使活性化合物與至少一種溶劑或稀釋劑、乳化劑、分散劑及/或黏合劑或固著劑、防水劑、視需要之乾燥劑及 UV 安定劑、及視需要之著色劑與色料及其他加工佐劑混合。

- 10 用於保護木頭及原木產品之殺昆蟲組成物或濃縮物所含根據本發明活性化合物濃度為 0.0001 至 95 重量%，特別是 0.001 至 60 重量%。

- 所用組成物或濃縮物之量視昆蟲品種與多寡及其介質而異，其最適量於各情形下，可以施用試驗系列予以測定。然而，一般而言，以欲保護之物料計，使用 0.0001 至 20
15 重量%，較佳為 0.001 至 10 重量%活性化合物即夠。

適宜溶劑及/或稀釋劑為有機化學溶劑或溶劑混合物，及/或低揮發性油性或油型有機化學溶劑或溶劑混合物，及/或極性有機化學溶劑或溶劑混合物，及/或水，及適當時，可使用乳化劑及/或潤濕劑。

- 20 宜用之有機化學溶劑為蒸發值在 35 以上及閃點在 30℃ 以上，較好在 45℃ 以上，之油性或油型溶劑，或溶劑混合物。所用不溶於水且具有低揮發性之此等油性或油型溶劑，為適當之無機油或其芳香族餾分、或含無機油之溶劑混合物，以松香水、石油醚及/或烷基苯為佳。

五、發明說明（⁵²）

以使用沸點範圍在 170 至 220°C 間之無機油、沸點範圍在 170 至 220°C 間之松香水、沸點範圍在 250 至 350°C 間之紡錘油、及沸點範圍在 160 至 280°C 間之石油醚與芳香族化合物、萜烯類之油等為有利。

- 5 於一較佳具體實例中，係使用沸點範圍在 180 至 210°C 間之液態脂族烴、或沸點範圍在 180 至 220°C 間的芳族與脂族烴之高沸點混合物、及/或紡錘油及/或單氯萘，較佳為 α -單氯萘。

- 10 低揮發性、蒸發值在 35 以上及閃點在 30°C 以上，較好在 45°C 以上，之有機油性或油型溶劑，可由高至中度揮發性有機化學溶劑部分取代，只要該溶劑混合物具有 35 以上之蒸發值，及 30°C 以上，較好 45°C 以上之閃點，及該混合物可溶解或乳化於此溶劑混合物中。

- 15 於一較佳具體實例中，有些有機化學溶劑或溶劑混合物、或脂族極性有機化學溶劑或溶劑混合物被取代。較佳為使用含羥基及/或酯基及/或醚基之脂族有機化學溶劑，例如，乙二醇醚、酯等。

- 20 欲達本發明目的所用之有機化學黏合劑為本質上已知、可於水中稀釋及/或於所用有機化學溶劑中溶解、分散或乳化之合成樹脂及/或黏合乾燥用油，特別是包括，或包含，丙烯酸酯樹脂、乙烯樹脂（例如聚乙烯乙酸酯）、聚酯樹脂、聚縮合或聚加成樹脂、聚脲烷樹脂、醇酸樹脂或經改質之醇酸樹脂、苯酚樹脂、烴樹脂（例如茛/香豆酮樹脂）、矽酮樹脂、乾性植物油及/或乾性油之黏合劑，及/或

五、發明說明 (53)

以天然及/或合成樹脂為基質之物理性乾燥黏合劑。

- 作為黏合劑用之合成樹脂可呈乳液、分散液或溶液之形式而使用。也可使用其量多達 10 重量%之瀝青或瀝青物質作為黏合劑。此外，可使用本質上已知之著色劑、色料、
- 5 防水劑、掩味劑、及抑制劑或抗腐蝕劑等。

根據本發明，組成物或濃縮物較好包括至少一種醇酸樹脂或經改質之醇酸樹脂及/或乾燥植物油作為有機化學黏合劑。根據本發明宜用之醇酸樹脂為其油含量在 45 重量%以上，較佳為 50 至 68 重量%，之醇酸樹脂。

- 10 上述黏合劑之一些或全部，可以固著劑(混合物)或增塑劑(混合物)取代。這些添加劑意在防止活性化合物揮發，及結晶或沉澱。以所用黏合劑為 100%計，較佳為取代黏合劑之 0.01 至 30%。

- 增塑劑係得自酞酸酯(例如酞酸二丁酯、酞酸二辛酯、
- 15 或酞酸苺基丁酯)、磷酸酯(例如磷酸三丁酯)、己二酸酯[例如己二酸二-(2-乙基己基)酯]、硬脂酸酯(例如硬脂酸丁酯或硬脂酸戊酯)、油酸酯(例如油酸丁酯)、甘油醚或高分子量乙二醇醚、甘油酯及對甲苯磺酸酯等化學組群。

- 固著劑係以聚乙烯烷基醚(例如，聚乙烯甲基醚)、或
- 20 酮(例如二苯甲酮與仲乙基二苯甲酮)為化學基質。

其他適當之溶劑或稀釋劑為，特別是，水，及適當時，與一或多種上述有機化學溶劑或稀釋劑、乳化劑及分散劑之混合物。

特別有效之原木保護係利用工業規模浸漬法，例如，

五、發明說明 (54)

真空法、雙重真空法或壓力法而達成。

如果適當，現成可用之組成物亦可含其他殺昆蟲劑及一或多種附加之殺真菌劑。

根據本發明之活性化合物組成物同時可用於保護與鹽
5 水或微鹼水接觸之物體，例如船體、隔板、網製品、建造物、停泊處及防附生信號系統。

被固著性寡毛綱 (*Oligochaeta*) 動物 [例如龍介蟲科 (*Serpulidae*)]、貝殼及鵝頸茗荷介類 [例如各種茗荷屬 (*Lepas*) 與鎧茗荷 (*Scalpellum*) 類、櫟實茗荷介類 [例如藤壺
10 (*Balanus*) 或 *Pollicipes* 類] 附生，均會增加船體的磨擦阻力，結果，由於高能量消耗，加上時常停駐於乾燥船塢，將導致操作成本明顯增加。

除了被藻類 (例如 *Ectocarpus spp.* 與 *Ceramium spp.*) 附生外，以被屬名為 *Cirripedia* (蔓腳甲殼類) 之固著性
15 *Entomostraka* 類動物附生特別具重要性。

令人驚奇地，頃發現根據本發明之活性化合物組成物具有顯著的抗附生 (antifouling) 作用。

使用根據本發明之活性化合物組成物，俾使無需使用重金屬類化合物，例如，硫化雙(三烷基錫)、月桂酸三正
20 丁錫、氯化三正丁錫、氧化銅(I)、氯化三乙錫、三正丁基(2-苯基-4-氯苯氧基)錫、氧化三丁錫、二硫化鉬、氧化銻、聚合鈦酸丁酯、氯化苯基-(雙吡啶)-鈹、氟化三正丁錫、伸乙基雙硫基胺甲酸鋅、二甲基二硫代胺甲酸鋅、伸乙基雙硫基胺甲酸鋅、2-吡啶硫醇 1-氧化物之鋅鹽及銅鹽、伸乙

五、發明說明 (55)

基雙硫基胺甲酸雙二甲基二硫代胺甲醯鋅、氧化鋅、伸乙基雙二硫代胺甲酸銅(I)、硫氰酸銅、環烷酸銅及鹵化三丁錫，或這些化合物濃度實質減少。

如果適當，則現成可用之抗附生漆料可附加地包括其
5 他活性化合物，較佳為殺藻劑、殺真菌劑、除草劑、殺軟體動物劑、或其他抗附生活性化合物。

與根據本發明之抗附生組成物組合使用之較適當成分為：

殺藻劑例如 2-第三丁胺基-4-環丙胺基-6-甲硫基
10 -1,3,5-三吡啶、二氯芬(dichlophen)、達有龍(diuron)、安多殺(endothal)、三苯乙錫(fentine acetate)、愛速普隆(isoproturon)、滅殺塞隆(methabenzthiazuron)、復祿芬(oxyfluorfen)、快拉明(quinoclamine)及得佈丁(terbutryn)；

殺真菌劑例如苯並[b]噻吩羧酸環己醯胺 S,S-二氧化
15 物、益發靈(dichlofluanid)、氟福爾培(fluorfolpet)、丁基胺甲酸 3-碘-2-丙烯酯、多利寧及唑類例如亞賽座(azaconazole)、賽洛克座、依普座(epoxyconazole)、菲克利、滅康座、普克利及得克利；

殺軟體動物劑例如三苯醋錫、滅達害、滅賜克、尼沙
20 密(niclosamid)、硫敵克及三美克；

或習知抗附生活性化合物例如 4,5-二氯-2-辛基-4-異噻唑啉-3-酮、二碘甲基對三苯甲基碲、2-(N,N-二甲基硫代胺甲醯基硫基)-5-硝基噻唑基、2-吡啶硫醇 1-氧化物之鉀、銅、鈉及鋅鹽、吡啶-三苯基硼烷、四丁基二錫噁烷、2,3,5,6-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (56)

四氯-4-(甲基磺醯基)-吡啶、2,4,5,6-四氯間苯二腈、二硫化四甲基秋蘭姆(thiuram)及 2,4,6-三氯苯基馬來醯亞胺。

所用抗附生組成物包括濃度為 0.001 至 50 重量%，特別是 0.01 至 20 重量%之根據本發明活性化合物組成。

5 此外，根據本發明之抗附生組成物亦包括，例如，見述於 Ungerer, *Chem. Ind.* **1985**, 37, 730-732 及 Williams, *Antifouling Marine Coatings*, Noyes, Park Ridge, **1973** 之習知成分。

除了殺藻劑、殺真菌劑、殺軟體動物活性化合物及根據本發明之殺昆蟲活性化合物外，抗附生漆料包括，特別是，黏合劑。

認可之黏合劑實例為溶劑系中之聚氯乙烯、溶劑系中之氯化橡膠、溶劑系中(特別是水性系中)之丙烯酸樹脂、呈水性分散液形式或有機溶劑系形式之氯乙烯/乙酸乙烯酯共聚物系、丁二烯/苯乙烯/丙烯腈橡膠、乾性油例如亞麻油、樹脂酯或經改質之硬化樹脂與焦油或瀝青之組合、柏油及環氧化合物、少量氯橡膠、氯化聚丙烯及乙烯樹脂。

適當時，漆料亦包括較好不溶於鹽水中之無機色料、有機色料或著色劑。漆料可進一步包括松香，以容許活性化合物之控制釋放。此外，漆料可包括增塑劑、影響流變特性之改質劑及其他習知成分。根據本發明之化合物或上述混合物亦可併入自行磨光之抗附生系中。

根據本發明之活性化合物組成物亦適用於防治動物害物，特別是在包圍的空間，例如住宅、工廠通道、辦公室、

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (57)

艙位等處發現的昆蟲、蜘蛛及蟎。於家畜用殺昆蟲劑產物中，活性化合物組成可單獨使用，或與其他活性化合物及輔助劑併用，以防治前述害物。其對於敏感及有抗性之品系，及所有發育階段均具活性。這些害物包含：

- 5 屬於蠍目(Scorpionidea)者，例如，歐亞蠍屬之 *Buthus occitanus*；

- 屬於蟎目(Acarina)者，例如，雞壁蝨(*Argas persocis*)、鵠壁蝨(*Argas reflexus*)、苔蟎屬(*Bryobia spp.*)、雞皮刺蟎(*Dermanyssus gallinae*)、住家食甜恙蟲
10 (*Glyciphagus domesticus*)、非洲鳥壁蝨(*Ornithodoros moubat*)、血色扇頭蝨蟲(*Rhipicephalus sanguineus*)、刺激秋恙蟲(*Trombicula alfreddugesi*)、*Neutrombicula autumnalis*、歐洲家刺皮蟎(*Dermatophagoides pteronissimus*)、美洲家刺皮蟎(*Dermatophagoides forniae*)；

- 15 屬於蜘蛛目(Araneae)者，例如，*Aviculariidae*、圓蛛科(*Araneidae*)；

屬於盲蛛目(Opiliones)者，例如，*Pseudoscorpiones chelifer*、*Pseudoscorpiones cheiridium*、*Opiliones phalangium*；

- 20 屬於等足目者，例如，海蛆屬之 *Oniscus asellus*、*Porcellio scaber*；

屬於雙足目者，例如，*Blaniulus guttulatus*、帶馬陸屬(*Polydesmus spp.*)；

屬於唇足目者，例如，地蜈蚣屬(*Geophilus spp.*)；

五、發明說明 (58)

屬於 *Zygentoma* 目者，例如，衣魚屬 (*Ctenolepisma spp.*)、西洋衣魚 (*Lepisma saccharina*)、*Lepismodes inquilinus*；

- 屬於蜚蠊目者，例如，東方蜚蠊 (*Blatta orientalis*)、
 5 德國小蠊 (*Blattella germanica*)、*Blattella asahinai*、馬得拉蜚蠊 (*Leucophaea maderae*)、蜚蠊屬 (*Panchlora spp.*)、*Parcoblatta spp.*、澳洲大蠊 (*Periplaneta australasiae*)、美洲大蠊 (*Periplaneta americana*)、褐色大蠊 (*Periplaneta brunnea*)、烟色大蠊 (*Periplaneta fuliginosa*)、長鬚蜚蠊
 10 (*Supella longipalpa*)；

屬於跳躍目 (*Saltatoria*) 者，例如，家蟋蟀 (*Acheta domesticus*)；

屬於革翅目者，例如，歐洲球蝨 (*Forficula auricularia*)；

- 15 屬於等翅目者，例如，木白蟻屬 (*Kaloterms spp.*)、白蟻屬 (*Reticulitermes spp.*)；

屬於啮蟲目 (*Psocoptera*) 者，例如，書虱屬 (*Lepinatus spp.*)、書虱屬 (*Liposcelis spp.*)；

- 屬於鞘翅目者，例如，皮蠹屬 (*Anthrenus spp.*)、黑皮蠹屬 (*Attagenus spp.*)、皮蠹屬 (*Dermestes spp.*)、長頭谷盜 (*Latheticus oryzae*)、郭公蟲屬 (*Necrobia spp.*)、蛛甲屬 (*Ptinus spp.*)、谷蠹屬之 *Rhizopertha dominica*、谷象 (*Sitophilus granarius*)、米象 (*Sitophilus oryzae*)、玉米象 (*Sitophilus zeamais*)、藥材谷盜 (*Stegobium paniceum*)；
 20

五、發明說明 (59)

屬於雙翅目者，例如，埃及黑蚊(*Aedes aegypti*)、白斑蚊(*Aedes albopictus*)、黑斑蚊(*Aedes taeniorhynchus*)、按蚊屬(*Anopheles spp.*)、紅頭麗蠅(*Calliphora erythrocephala*)、*Chrysozona pluvialis*、五帶淡色庫蚊

5 (*Culex quinquefasciatus*)、家蚊(*Culex pipiens*)、烏蚊(*Culex tarsalis*)、果蠅屬(*Drosophila spp.*)、黃腹廢蠅(*Fannia canicularis*)、家蠅(*Musca domestica*)、糠蚊屬(*Phlebotomus spp.*)、麻蠅屬(*Sarcophaga spp.*)、蚋蠅屬(*Simulium spp.*)、螫蠅(*Stomoxys calcitrans*)、歐洲大蚊(*Tipula paludosa*)；

10 屬於鱗翅目者，例如，小蠟螟(*Achroia grisella*)、大蠟螟(*Galleria mellonella*)、印度谷螟(*Plodia interpunctella*)、衣蛾屬之 *Tinea cloacella*、網衣蛾(*Tinea pellionella*)、袋衣蛾(*Tineola bisselliella*)；

15 屬於蚤目者，例如，犬蚤(*Ctenocephalides canis*)、貓蚤(*Ctenocephalides felis*)、人蚤(*Pulex irritans*)、穿皮潛蚤(*Tunga penetrans*)、東方鼠蚤(*Xenopsylla cheopis*)；

屬於膜翅目者，例如，大黑蟻(*Camponotus herculeanus*)、黑草蟻(*Lasius fuliginosus*)、普通黑蟻(*Lasius niger*)、*Lasius umbratus*、廚蟻(*Monomorium pharaonis*)、

20 *Paravespula spp.*、鋪道蟻(*Tetramorium caespitum*)；

屬於虱目者，例如，頭虱(*Pediculus humanus capitis*)、衣虱(*Pediculus humanus corporis*)、陰虱(*Phthirus pubis*)；

屬於異翅亞目者，例如，熱帶臭蟲(*Cimex hemipterus*)、臭蟲(*Cimex lectularius*)、*Rhodnius prolixus*、

五、發明說明 (60)

獵蝨屬之 *Triatoma infestans*。

於居家使用之殺昆蟲劑部分，活性化合物亦可與其他適當的活性化合物例如磷酸酯、胺甲酸酯、擬除蟲菊酯、生長調節劑或得自其他已知殺昆蟲類之活性化合物併用。

- 5 彼等係呈氣溶膠、無壓力之噴霧產品(例如泵送及噴霧器噴霧物)、自動生霧系統、生霧器(foggers)、泡沫、凝膠、具有以纖維素或聚合物製成的蒸發器錠劑之蒸發器產品、液體蒸發器、膠及膜蒸發器、由推進器驅動之蒸發器、無能量或被動蒸發系、蛾紙、蛾袋與蛾膠、呈粒劑或粉塵、
- 10 供撒佈之餌料或於置餌處予以使用。

使用根據本發明之活性化合物組成物時，施加率視施用類別而定，可於相當寬廣範圍內有所不同。於處理部分植物體時，活性化合物之施加率通常在 0.1 與 10,000 g/ha 之間，較好在 10 與 1,000 g/ha 之間。

- 15 由下文實例可看出，根據本發明之活性化合物組成物具有良好的殺昆蟲及殺蝨作用。雖然個別活性化合物的作用較弱，惟組成物顯示超越個別作用單純總和之作用。

- 當活性化合物組成之作用超出個別施用的活性化合物作用之總和時，則該等殺昆蟲劑及殺蝨劑中即存在增效之
- 20 效果。

對於含有兩種活性化合物之既定組成，其預期作用可使用 S.R. Colby, Weeds 15 (1967), 20-22 之等式計算如下：
若

X 為使用施加率 m g/ha 或濃度 m ppm 之活性化合物 A

五、發明說明 (61)

時之致死率，

Y 為使用施加率 $\underline{n}$ g/ha 或濃度 $\underline{n}$ ppm 之活性化合物 B 時之致死率及

E 為使用施加率 $\underline{m}$ 及 $\underline{n}$ g/ha 或濃度 $\underline{m}$ 及 $\underline{n}$ ppm 之活性
5 化合物 A 及 B 時之致死率，

則

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

其中，致死率以 % 表示；0% 意指致死率與對照相當，而 100%
10 致死率意指未觀察到害物之侵襲。

如果實際效果超過計算值，組成物之作用超增加，亦即增效作用存在。於此情形下，實際觀測之致死率必大於上式預期致死率(E)之計算值。

五、發明說明 (62)

實例 A

棉蚜 (*Aphis gossypii*) 試驗

溶劑： 3 重量份二甲基甲醯胺

乳化劑： 1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

- 5 為了製造活性化合物之適當製劑，使 1 重量份活性化合物與所述量溶劑及乳化劑混合，以水稀釋此濃縮物至所需濃度。

處理受棉蚜嚴重侵襲的棉葉 (*Gossypium hirsutum*)，將其浸漬於具有所需濃度之活性化合物製劑中。

- 10 經要需要的期間後，測定致死率(%)。100%意指所有蚜蟲均被殺死；0%意指沒有蚜蟲被殺死。致死率係使用 Colby 氏等式而測定。

於此試驗中，舉例而言，與個別施加活性化合物相較下，根據本發明之下述活性化合物組成物表現增效之加強

- 15 活性：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (63)

表 A - 1

傷害植物之昆蟲

棉蚜試驗

活性化合物	活性化合物濃度 (ppm)	6 天後之致死率 (%)	
Ex. I-10 已知	1.6	0	
Ex. II-a 已知	1.6	25	
Ex. I-10+ Ex. II-a (1:1)根據本發明	1.6 + 1.6	實測值 *	計算值 **
		95	25

5

*實測值=實測之活性

**計算值=使用 Colby 氏等式計算之活性

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (64)

表 A -2

傷害植物之昆蟲

棉蚜試驗

活性化化合物	活性化化合物濃度 (ppm)	1 天後之致死率 (%)	
Ex. I-10 已知	8	0	
Ex. II-g 已知	8	70	
Ex. I-10+ Ex. II-g (1:1)根據本發明	8 + 8	實測值 *	計算值 **
		95	70

5

*實測值=實測之活性

**計算值=使用 Colby 氏等式計算之活性

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (65)

實例 B

瘤額蚜試驗

溶劑： 3 重量份二甲基甲醯胺

乳化劑： 1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

- 5 為了製造活性化合物之適當製劑，使 1 重量份活性化合物與所述量溶劑及乳化劑混合，以水稀釋此濃縮物至所需濃度。

處理受桃蚜 (*Myzus persicae*) 嚴重侵襲的甘藍葉 (*Brassica oleracea*)，將其浸漬於具有所需濃度之活性化合物製劑中。

10

經要需要的期間後，測定致死率(%)。100%意指所有蚜蟲均被殺死；0%意指沒有蚜蟲被殺死。致死率係使用 Colby 氏等式計算。

於此試驗中，舉例而言，與個別施加活性化合物相較

15 下，根據本發明之下述活性化合物組成物表現增效之加強活性：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (66)

表 B - 1

傷害植物之昆蟲

瘤額蚜試驗

活性化合物	活性化合物濃度 (ppm)	6 天後之致死率 (%)	
Ex. I-10 已知	1.6	5	
Ex. II-k 已知	1.6	10	
Ex. I-10+ Ex. II-k (1:1)根據本發明	1.6 + 1.6	實測值*	計算值**
		80	14.5

5

*實測值=實測之活性

**計算值=使用 Colby 氏等式計算之活性

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (67)

表 B - 2

傷害植物之昆蟲

瘤額蚜試驗

活性化合物	活性化合物濃度 (ppm)	6 天後之致死率 (%)	
Ex. I-10 已知	1.6	0	
Ex. II-g 已知	1.6	10	
Ex. I-10+ Ex. II-g (1:1)根據本發明	1.6 + 1.6	實測值*	計算值**
		95	10

5

*實測值=實測之活性

**計算值=使用 Colby 氏等式計算之活性

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (68)

表 B - 3

傷害植物之昆蟲

瘤額蚜試驗

活性化化合物	活性化化合物濃度 (ppm)	1 天後之致死率 (%)	
Ex. I-10 已知	1.6	0	
Ex. II-m 已知	1.6	15	
Ex. I-10+ Ex. II-m (1:1)根據本發明	1.6 + 1.6	實測值*	計算值**
		45	15

5

*實測值=實測之活性

**計算值=使用 Colby 氏等式計算之活性

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (69)

實例 C

臨界濃度試驗/土壤昆蟲 - 基因轉移植物之處理

試驗動物：黃瓜條葉甲 (*Diabrotica balteata*)-土壤中之幼蟲

溶劑： 7 重量份丙酮

5 乳化劑： 1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

為了製造活性化合物之適當製劑，使 1 重量份活性化合物與所述量溶劑混合，添加所述量乳化劑，以水稀釋此濃縮物至所需濃度。

傾倒活性化合物製劑於土壤上，此處，實際上無關於
10 製劑中活性化合物的濃度，惟與每單位體積土壤所含活性化合物的重量[以 ppm (mg/l)表示]有關。填裝此土壤於 0.25 升盆中，於 20°C 令其靜置。

準備好後，立即於各盆中置入 5 株先行發芽處理之玉米變種 YIELD GUARD(美國 Monsanto 公司之商標)。2 天
15 後，將試驗昆蟲置入處理好的土壤中。再經過 7 天後，計算出現之玉米株，以測定活性化合物之效力(1 株=20%效力)。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (70)

實例 D

美洲煙草夜蛾(*Heliothis virescens*)試驗 - 基因轉移植物之處理

溶劑： 7 重量份丙酮

5 乳化劑： 1 重量份烷基芳基聚乙二醇醚

為了製造活性化合物之適當製劑，使 1 重量份活性化合物與所述量溶劑及所述量乳化劑混合，以水稀釋此濃縮物至所需濃度。

將大豆苗 (*Glycine max*) 變種 Round Ready(美國
10 Monsanto 公司之商標)浸於所需濃度之活性化合物製劑中進行處理，在葉子仍潮濕時，置入煙草芽蟲 *Heliothis virescens*。

經需要之期間後，測定昆蟲致死率。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂

93.10.2

年 月 日

修正
補充

公 告 本

I228121

申請日期	90.5.11
案 號	90111209
類 別	C07D ^{207/36} .S21/00.ACIN ^{43/36} .

專利申請案第 90111209^{A4} 號

ROC Patent Appln.No. 90111209

修正後無劃線之中文說明書第 1、2 頁修正頁 - 附件(四)

Amended Pages of the Chinese Specification- Encl.(IV)

(民國 93 年 10 月 20 日送呈)

(Submitted on October 20, 2004)

(以上各欄由本局填註)

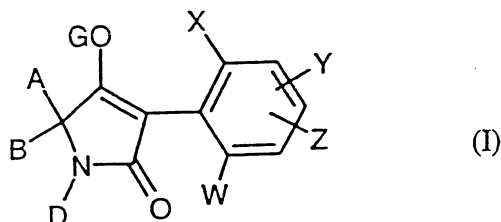
43/38

發 明 專 利 說 明 書

一、發明 名稱	中 文	具殺昆蟲性質之活性化合物組成物
	英 文	Active compound combinations having insecticidal properties
二、發明 創作人	姓 名	1.費瑞尼 Reiner FISCHER 2.爾克林 Christoph ERDELEN
	國 籍	1.~2.皆為德國
	住、居所	1.德國莫漢區奈利沙街 23 號 Nelly-Sachs-Str. 23, 40789 Monheim, Germany 2.德國麗奇林肯區安堤布克爾 15 號 Unterbüscherhof 15, 42799 Leichlingen, Germany
三、申請人	姓 名 (名稱)	德商拜耳廠股份有限公司 Bayer Aktiengesellschaft
	國 籍	德國
	住、居所 (事務所)	德國利佛可生城拜耳工業區 D 51368 D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Federal Republic of Germany
	代 表 人 姓 名	白羅夫 (Dr. Rolf Braun) 羅勞斯 (Dr. Klaus Reuter)

四、中文發明摘要（發明之名稱： 具殺昆蟲性質之活性化合物組成物 ）

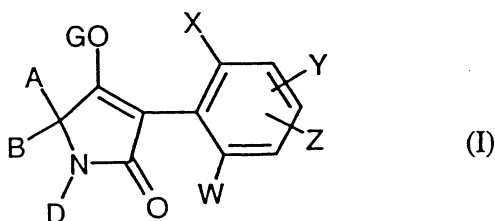
本發明乃有關殺昆蟲之混合物，該混合物包括具式(I)之化合物



（式中 W、X、Y、Z、A、B、D 及 G 各如說明書中之界定）
及菸鹼酸乙醯膽鹼受體之激動劑或拮抗劑，係用於保護植物免受昆蟲侵襲。

英文發明摘要（發明之名稱： Active compound combinations having insecticidal properties

The invention relates to insecticidal mixtures, comprising compounds of the formula (I)



in which W, X, Y, Z, A, B, D and G are each as defined above and agonists or antagonists of nicotinic acetylcholine receptors for protecting plants against attack by pests.

六、申請專利範圍

專利申請案第 90111209 號

ROC Patent Appln. No. 90111209

修正後無劃線之申請專利範圍中文本 - 附件(一)

Amended Claims in Chinese - Encl. (I)

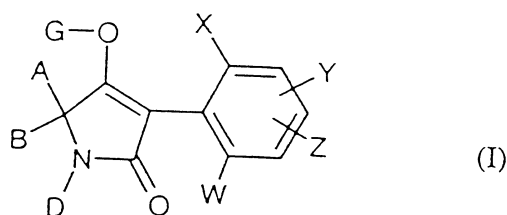
5

(民國 93 年 10 月 20 日送呈)

(Submitted on October 20, 2004)

1. 一種殺昆蟲組成物，係包括式(I)化合物，

10



式中

X 代表鹵基、或 C₁₋₆ 烷基，

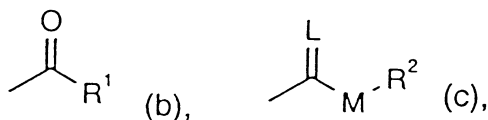
15

W、Y 與 Z 各自獨立地代表氫、鹵基、或 C₁₋₆ 烷基，A 和 B 及與其連接的碳原子一起代表經 R 基取代之 C₃₋₈環烷基，其中 R 代表 C₁₋₆ 烷氧基，

D 代表氫，

G 代表氫(a)或代表下列基團之一

20



25

其中

L 代表氧，

M 代表氧，

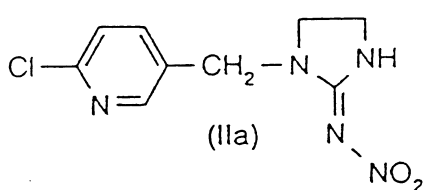
六、申請專利範圍

R^1 代表 C_{1-6} 烷基，或可被 O 及 N 介入之 C_{3-8} 環烷基，

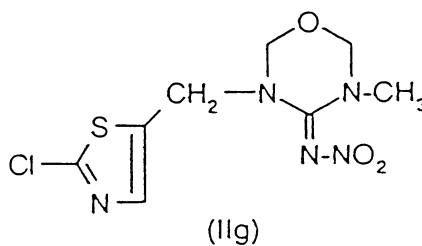
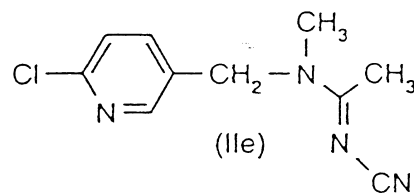
R^2 代表 C_{1-6} 烷基，

及至少一種選自下述化合物的菸鹼酸乙醯膽鹼受體之

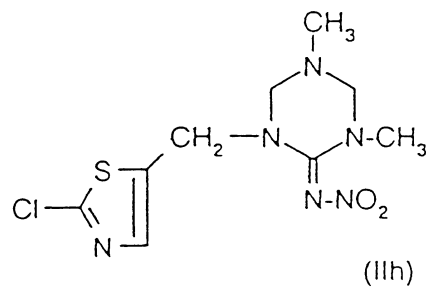
5 激動劑或拮抗劑之具有增效活性之混合物，



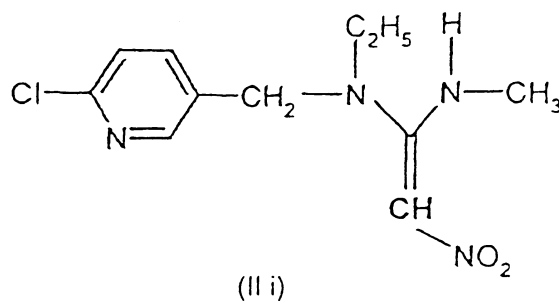
或



或

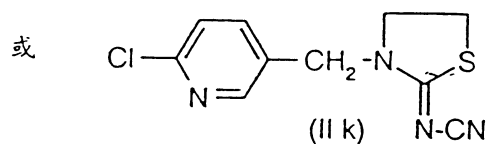


或

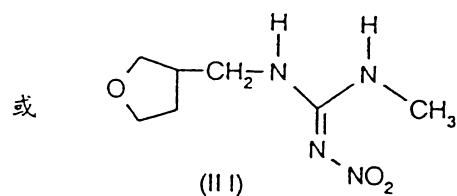


六、申請專利範圍

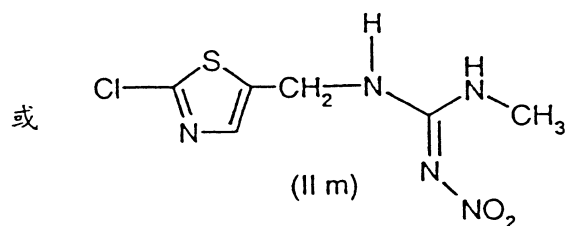
5



10

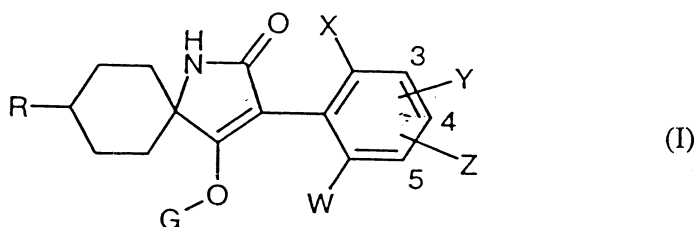


15



2. 根據申請專利範圍第 1 項之組成物，包括式(I)化合物

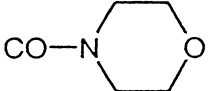
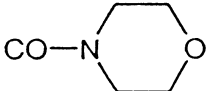
20



其中

W、X、Y、Z、R 與 G 各如下文表中所界定。

六、申請專利範圍

5	W	X	Y	Z	R	G
	H	Br	5-CH ₃	H	OCH ₃	CO-i-C ₃ H ₇
	H	Br	5-CH ₃	H	OCH ₃	CO ₂ -C ₂ H ₅
	H	CH ₃	5-CH ₃	H	OCH ₃	H
	H	CH ₃	5-CH ₃	H	OCH ₃	CO ₂ -C ₂ H ₅
10	CH ₃	CH ₃	3-Br	H	OCH ₃	H
	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H	OCH ₃	H
	H	Br	4-CH ₃	5-CH ₃	OCH ₃	CO-i-C ₃ H ₇
	H	CH ₃	4-Cl	5-CH ₃	OCH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅
	H	CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃	OCH ₃	
15	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃	4-CH ₃	OCH ₃	H
	H	CH ₃	5-CH ₃	H	OC ₂ H ₅	
	CH ₃	CH ₃	3-Br	H	OC ₂ H ₅	CO-i-C ₃ H ₇
	H	CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃	OC ₂ H ₅	CO-n-Pr
	H	CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃	OC ₂ H ₅	CO-i-Pr
	H	CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃	OC ₂ H ₅	CO-c-Pr

3. 根據申請專利範圍第 1、2、3、4 或 5 項之組成物，包括比率為 1:100 至 100:1 之式(I)化合物及菸鹼酸乙醯膽鹼受體之激動劑或拮抗劑。

20 4. 根據申請專利範圍第 1 項之組成物，其係用於防治動物害物。