

公告本

申請日期	86.12.24. 87.2.2
案 號	86119718
類 別	A01N 09/56

A4
C4

505503

(以上各欄由本局填註)

發明專利說明書

一、發明 名稱	中 文	殺有害生物性1-芳基吡唑
	英 文	"PESTICIDAL 1-ARYLPYRAZOLES"
二、發明 人	姓 名	1. 珍尼佛 菲立普斯 2. 米歇爾 皮拉托 3. 吳泰德
	國 籍	1-3. 均美國
	住、居所	1. 美國北卡羅萊納州阿潘克斯市郵箱220B號 RT 3 2. 美國北卡羅萊納州卡瑞市李文斯通路206號 3. 美國北卡羅萊納州雪波希爾市柯林森路200號
三、申請人	姓 名 (名稱)	法商隆寶蘭農化公司
	國 籍	法國
	住、居所 (事務所)	法國里昂14-20, RUE PIERRE BAIZET,
	代 表 人 姓 名	派崔克·吉尼

(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12月24日 60/033,887 ☒有 ☐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(1)

發明背景1. 發明領域

本發明係有關一種可用以防治昆蟲、線蟲或寄生蟲之3-乙醯基-1-芳基吡唑衍生物，及有關含此衍生物之組合物。本發明方法尤其有關在某些工作者發覺似乎需要之狀況下施用該1-芳基吡唑衍生物。本發明亦有關一種防治昆蟲、線蟲及寄生蟲之新穎改良方法，係使用其內含有1-苯基吡唑基之殺蟲活性物質且尤其可用於防治蚜蟲。

2. 相關領域之描述

藉由其內含有1-芳基吡唑基之活性物質防治昆蟲、線蟲或寄生蟲已述於許多專利或專利申請案中，如國際專利公報WO 93/06089號(及對應之USP. 5,451,598)，WO 94/21606及WO 87/03781以及歐洲專利公告號0295117，659745，679650，201852及412849，德國專利DE 19511269及USP 5,232,940。

本發明之第一目的係提供一種對使用者及環境具改良安全程度之防治昆蟲、線蟲或寄生蟲之方法。所有殺有害生物劑通常更具或較不具危險性，且經常需要降低存在時之潛在危害性，即使其在正常使用為相當低且可接受者。因此本發明之目的係發展一種與已知且既有方法相較其中潛在危險性已降低之防治方法，即使既有之危險性已低且可接受。

本發明之第二個目的係降低對使用此方法之操作者之危害性。

五、發明說明(2)

本發明之第三個目的係對使用此方法之實質上可曝露在此環境之操作者降低危害性。

本發明之第四個目的係提供一種防治蚜蟲之新穎且更佳之方法。藉許多殺蟲活性物質防治蚜蟲為已知但該等昆蟲種類在發展成對殺有害生物劑實質上有更高抗藥性危險性而比其他昆蟲物種更極快速地繁殖生長。因而高度需要發展一種使用目前所用者以外之殺有害生物劑之新穎防治方法。本發明之目的係提供一種防治方法，係使用具高效率之1-苯基吡唑型之殺有害生物活性物質，且若可能，其效率比目前已知所用方法更佳。

本發明之第五個目的係提供一種新穎之1-苯基吡唑衍生物，其與已知化合物相較具有改良之組織性殺蚜蟲活性。該等化合物在組織性施用時具有優異之防治棉蚜(Aphis gossypii)及麥二盆蚜(Schizaphis graminum)之性質。

本發明該等及其他目的將可由下列之描述變得更易明瞭，且全部或部份目的可由本發明達成。

發明概述

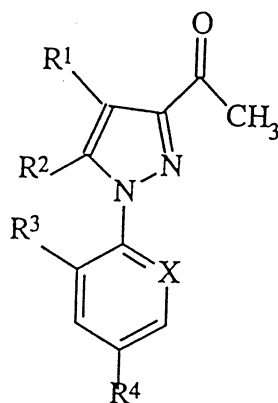
本發明提供一種防治昆蟲之改良方法，係對存在或預期會存在有昆蟲之區域施用含1-芳基吡唑基之殺有害生物活性成分，該施用係在哺乳類會曝露尤其是實質上會曝露之狀況下進行，該改良處為該活性成分在吡唑環上具有3-乙醯基取代基。本發明之防治方法尤適用於操作者須曝露於其中者。

本發明亦提供一種防治昆蟲之方法，係對存在或預期會存

五、發明說明(3)

在有蚜蟲之區域施用含有1-芳基吡唑基之殺有害生物活性成分，該改良處為該活性成分在吡唑環上具有3-乙醯基取代基。

尤其本發明之施用係使用式(I)之活性成分：



(I)

其中：

R^1 為 $S(O)_m R^5$ ；

R^2 係選自氫原子，鹵原子， $-NR^6 R^7$ ， $-S(O)_n R^8$ ， $C(O)R^8$ ， $C(O)OR^9$ ，烷基，鹵烷基， $-OR^9$ ，或 $-N=C(R^{10})(R^{11})$ ；

R^3 係選自鹵原子或氫原子；

R^4 係選自鹵原子或，鹵烷基，鹵烷氧基， $-S(O)_p CF_3$ ，或 $-SF_5$ ；

R^5 為烷基或鹵烷基；

R^6 及 R^7 係獨立選自氫原子，烷基，鹵烷基， $-C(O)R^8$ ， $C(O)OR^8$ ， $-S(O)_q CF_3$ ；其烷基部份係視情況經一或多個 R^{12} 取代；或 R^6 與 R^7 一起結合而形成在鏈中含有4至6個原子之二價基，此二價基伸烷基，伸烷氧基伸烷基或伸烷胺基伸烷基，較好係形成嗎啉、吡咯啉、六氫吡啉或六氫吡嘧

五、發明說明(4)

環；

R^8 為烷基或鹵烷基；

R^9 係選自烷基，鹵烷基或氫原子；

R^{10} 係選自 R^9 或烷氧基；

R^{11} 係烷基或鹵烷基；或選自苯基或雜芳基，其視情況經一或多個選自羥基、鹵素、烷氧基、 $-S(O)_r R^8$ ，氰基， R^8 或其組合所取代；

R^{12} 係選自氰基、硝基、烷氧基、鹵烷氧基、 $-S(O)_s$ -烷基， $-S(O)_s$ -鹵烷基， $C(O)$ -烷基， $-C(O)$ -鹵烷基， $-C(O)O$ -烷基， $C(O)O$ -鹵烷基，胺羰基，烷胺羰基，二烷胺羰基，羥基，胺磺醯基，烷胺磺醯基或二烷胺磺醯基；

X 係選自氮原子或 $C-R^{13}$ 基；

R^{13} 為鹵原子；及

m, n, p, q, r 及 s 彼此獨立代表 0、1 或 2 之值；

或其殺有害生物可接受性鹽。

"殺有害生物可接受性鹽" 意指其陰離子及陽離子為形成殺有害生物可接受性鹽領域中已知且可接受者。較好此種鹽為水溶性。由含胺基之式(I)化合物形成之酸加成鹽，包含與無機酸之鹽，例如鹽酸鹽，磷酸鹽，硫酸鹽及硝酸鹽，與有機酸之鹽例如乙酸鹽。由含羧酸基之式(I)化合物與鹼形成之適宜鹽，包含鹼金屬(如鈉或鉀)鹽，銨鹽及有機胺(如二乙胺或嗎啉)鹽。

發明詳細說明

除非另有說明，否則烷基及烷氧基含 1 至 4 個碳原子。鹵

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (5)

烷基及鹵烷基同樣地較好含有1至4個碳原子。各種個別脂肪烴部份，亦即基及其部份(例如烷胺羰基及烷胺磺鹽基之烷基部份)在鏈中含有達4個碳原子。

鹵烷基及鹵烷氧基可帶有一或多個鹵原子。

雜芳基表示含1至4個選自氮、氧及硫之雜原子之5至7員雜環。

鹵原子意指F、Cl、Br或I。在基之前之"鹵基"意指此基部份或完全鹵化，亦即經F、Cl、Br或I以任何組合取代，較好經F或Cl取代。

R^2 較好為胺基，其為未取代或帶有1或2個選自烷基、 $-C(O)R^8$ 及 $-C(O)OR^8$ 之基；其烷基部份係視情況經一或多個 R^{12} 取代。

R^3 較好為鹵原子；尤佳為氯原子； R^4 較好係選自鹵原子、鹵烷基、鹵烷氧基或 $-SF_5$ ；尤其為 CF_3- 、 CF_3O- 及 $-SF_5$ 。

R^5 較好為甲基、乙基或丙基。

通式(I)化合物因其組織性殺蚜蟲性質而尤佳者為其中：

R^2 為 NR^6R^7 ；

R^3 為鹵素；

R^4 為 CF_3- 、 CF_3O- 或 $-SF_5$ ；

R^5 為烷基；

X為 CR^{13} ；

R^{13} 為鹵素；及

m為0或1。

通式(I)化合物因其組織性殺蚜蟲活性而更特佳者為其

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (6)

中：

R^2 為 NR^6R^7 ；

R^3 為 氯；

R^4 為 CF_3 -、 CF_3O -或- SF_5 ；

R^5 為 烷基；

R^6 為 氫；

R^7 為 氫， $-S(O)_qCF_3$ 或視情況經 $-S(O)_sR^8$ 或胺羰基取代之烷基；

X 為 CR^{13} ；

R^{13} 為 氯或溴；及

m 為 0 或 1。

通式(I)化合物因其組織性殺蚜蟲性質而更佳者為其中：

R^2 為 NR^6R^7 ；

R^3 為 氯；

R^4 為 CF_3 -或- SF_5 ；

R^5 為 甲基或乙基；

R^6 為 氫；

R^7 為 氫，甲基或乙基，其視情況經 $-S(O)_sR^8$ 或胺羰基取代；

R^8 為 甲基或乙基；

R^9 為 甲基或乙基；

X 為 CR^{13} ；

R^{13} 為 氯或溴；及

m 為 0 或 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(7)

用於本發明防治昆蟲方法中之特佳吡啉衍生物包含下列。
編號1-12係指定該等化合物供參考及辨識。

1. 3-乙醯基-5-胺基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞磺醯基吡啉，
2. 3-乙醯基-5-胺基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲硫基吡啉，
3. 3-乙醯基-5-胺基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-乙基亞磺醯基吡啉，
4. 3-乙醯基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-5-乙胺基-4-甲基亞磺醯基吡啉，
5. 3-乙醯基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-5-甲胺基-4-甲基亞磺醯基吡啉，
6. 3-乙醯基-5-(胺甲醯基甲胺基)-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞磺醯基吡啉，
7. 3-乙醯基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-5-(2-乙磺醯基乙胺基)-4-甲基亞磺醯基吡啉，
8. 3-乙醯基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-5-(2-胺甲醯基乙胺基)-4-甲基亞磺醯基吡啉，
9. 3-乙醯基-5-胺基-1-(2-溴-6-氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞磺醯基吡啉，
10. 3-乙醯基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞磺醯基-5-三氟甲基氧硫基胺基吡啉，
11. 3-乙醯基-5-胺基-1-(2,6-二氯-4-五氟硫基苯基)-4-甲基亞磺醯基吡啉，

五、發明說明(8)

12.3-乙醯基-5-胺基-1-(2,6-二氯-4-五氟硫基苯基)-4-甲硫基吡啶。

以化合物1及2較佳。

可用於本發明之化合物中，某些為新穎且為本發明進一步特徵。下列代表性式(I)化合物亦為本發明之一部份。下表中，Et表示乙基，Pr表示正丙基。在未標示下標時，例如SCFCl₂意指SCFCl₂。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (9)

化合物編號	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	m.p. °C (大約)
13	SCFCl ₂	NH ₂	Cl	CF ₃	C-Cl	136
14	SO ₂ CF ₃	NH ₂	Cl	CF ₃	C-Cl	164
15	SCF ₃	H	Cl	CF ₃	C-Cl	
16	SCF ₃	N=CH(OEt)	Cl	CF ₃	C-Cl	
17	SOCF ₃	H	Cl	CF ₃	C-Cl	149
18	SO ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₃	C-Cl	119
19	SOCH ₃	NH ₂	Cl	OCF ₃	C-Cl	147
20	SOEt	NH ₂	Cl	CF ₃	N	69
21	SOCH ₃	NH(CH ₂) ₂ CN	Cl	CF ₃	C-Cl	
22	SOCH ₃	NH(CH ₂) ₂ COCH ₃	Cl	CF ₃	C-Cl	
23	SOCH ₃	NH ₂	Cl	CF ₃	N	92
24	SO ₂ CH ₃	NH ₂	Cl	OCF ₃	C-Cl	211
25	SCClF ₂	NH ₂	Cl	CF ₃	C-Cl	124
26	SCH ₃	NH ₂	Br	CF ₃	C-Cl	99
27	SO ₂ CH ₃	NH ₂	Cl	CF ₃	N	165
28	SOCH ₃	NH ₂	Br	CF ₃	C-Br	
29	SOCH ₃	NH ₂	H	CF ₃	C-Br	162
30	SOCH ₃	NH ₂	H	CF ₃	C-Cl	
31	SCH ₃	NH ₂	Cl	OCF ₃	C-Cl	151
32	SOCH ₃	CH ₃	Cl	CF ₃	C-Cl	138
33	SOCH ₃	NHEt	Br	CF ₃	C-Cl	124
34	SOCF ₃	NH ₂	Cl	CF ₃	C-Cl	177
35	SOEt	H	Cl	CF ₃	C-Cl	152
36	SO(CH ₂) ₂ F	NH ₂	Cl	CF ₃	C-Cl	140
37	SO ₂ Et	NHCH ₂ CONH ₂	Cl	CF ₃	C-Cl	212
38	SOCH ₃	NHCH ₃	Br	CF ₃	C-Cl	58
39	SOEt	NH(CH ₂) ₂ SO ₂ Et	Cl	CF ₃	C-Cl	106
40	SOCHF ₂	NH ₂	H	CF ₃	C-Cl	140
41	SOPr	NH ₂	Cl	CF ₃	C-Cl	147
42	SO ₂ CH ₃	NH(CH ₂) ₂ OCH ₃	Cl	CF ₃	C-Cl	54
43	SOCH ₃	NHCH ₂ C(CH ₃) ₂ OH	Cl	CF ₃	C-Cl	50
44	SOCH ₂ F	NH ₂	Cl	CF ₃	C-Cl	
45	SOEt	NHCH ₃	Cl	OCF ₃	C-Cl	138

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

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 (10)

46	SOCH3	H	Cl	CF3	C-Cl	174
47	SO2CH3	NH2	Br	CF3	C-Cl	199
48	SOEt	NH2	Br	CF3	C-Br	176
49	SOEt	NH2	Cl	OCF3	C-Cl	165
50	SEt	N(CH3)Et	Cl	CF3	C-Cl	78
51	SEt	NHCH3	Cl	CF3	C-Cl	
52	SOEt	NHCH3	Cl	CF3	C-Cl	148
53	SCH3	OEt	Cl	CF3	C-Cl	
54	SO2CH3	SCH3	Cl	CF3	C-Cl	122
55	SCH3	NH2	Cl	Cl	N	110
56	SO2CH3	NH2	Cl	Cl	N	200
57	SO2Et	NH2	Cl	CF3	C-Cl	178
58	SCH3	NH2	Br	OCF3	C-Br	140
59	SOCH3	NH2	Cl	Cl	N	160
60	SEt	NH2	Br	OCF3	C-Br	
61	SOEt	NH(CH2)2SO2CH3	Cl	CF3	C-Cl	123
62	SPr	NH2	Cl	CF3	C-Cl	89
63	SCH3	NH2	Br	CF3	C-Br	110
64	SCH3	NHCOCF3	Cl	CF3	C-Cl	155
65	S(CH2)2Cl	NH2	Cl	CF3	C-Cl	99
66	SO2CH3	NH2	Cl	SF5	C-Cl	250
67	SOCH3	N=CH(OCH3)	Cl	CF3	C-Cl	114
68	SOCH3	N(CH3)2	Cl	CF3	C-Cl	129
69	SOCH3	CH2CH2Br	Cl	CF3	C-Cl	
70	SCF3	H	Cl	CF3	C-Cl	88

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

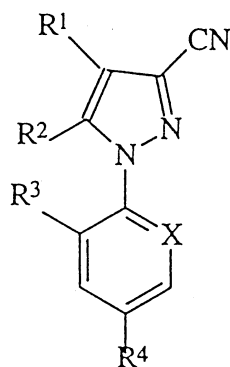
五、發明說明 (11)

合成方法及程序

式(I)化合物可依據國際專利公報 WO 94/21606 及 WO 93/06089 或國際專利公報 WO 87/03781 及歐洲專利公報 0295117 及 Hatton 等人之 USP 5,232,940 所述之製造方法製備。熟悉本技藝者將可在該等已知方法中選擇適當之起始反應物及採用該反應物之已知方法，而得所需之對應產物。須了解在下列製程描述中，在吡唑環上導入各種基之順序可以不同次序進行且對熟悉本技藝者悉知若需要可用適宜保護基。

下列製程描述中，當式(II)化合物出現之符號未特別界定時，須了解其係依據各符號於說明書中首次定義之"如前述定義"。

依據本發明之進一步特徵，其中 R^1 ， R^2 ， R^3 ， R^4 及 X 如前述定義之通式(I)化合物之製備，可使用(II)化合物：



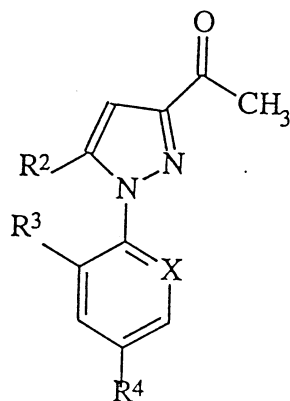
(II)

其中 R^1 ， R^2 ， R^3 ， R^4 及 X 如前述定義；與適宜試劑 CH_3M (其中 M 為鹼金屬如鋰) 或鹼土金屬鹽如 $MgBr$ ， $MgCl$ ， MgI 反應，該例中， CH_3N 為格林納試劑如溴化甲基鎂、碘化甲基鎂及氯化甲基鎂。此反應可在各種溶劑如二氯乙烷、二

五、發明說明 (12)

氯甲烷、甲苯、四氫呋喃及氯苯(可以混合物存在)在 -70°C 至 120°C 之溫度範圍內，較好自 -20°C 至 50°C 下進行。此反應可藉酸催化，包含路易士酸，如(但不限於) AlCl_3 ， BBr_3 ， TiCl_4 ， BF_3 ， SiCl_4 ， BCl_3 ， CuBr 。

依據本發明進一步特徵，其中 R^1 ， R^2 ， R^3 ， R^4 及 X 如前述定義且 m 代表0或1之通式(I)化合物之製備，可直接使式(III)化合物：



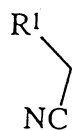
(III)

與適宜試劑 $\text{R}^5\text{S}(\text{O})_m\text{Y}$ 反應，其中 m 代表0或1及 Y 為鹵素(較好為氯)。式(III)化合物轉化成式(I)化合物可使用適宜之烷基氧硫基鹵化物或烷亞磺醯基鹵化物如甲基氧硫基鹵化物或甲亞磺醯基鹵化物直接氧硫基化或亞磺醯化而達成。烷基氧硫基鹵化物及烷亞磺醯基鹵化物可於另一瓶中製備或視情況就地在用以與式(III)化合物反應之介質中製備。通常使用惰性溶劑例如甲基第三丁醚，二氯乙烷；甲苯及氯苯。反應可在鹼性觸媒存在下進行，例如金屬碳酸鹽，金屬氫化物如氫化鈉，或金屬氫氧化物如氫氧化鈉。

五、發明說明 (13)

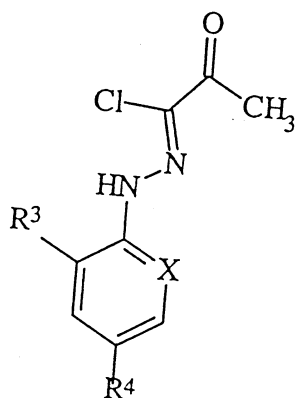
此反應可在自約 -20°C 至約 120°C 之溫度，較好在 0°C 至 100°C 之溫度進行。

依據本發明之進一步特徵，其中 R^1 ， R^2 ， R^3 ， R^4 及 X 如前述定義及 R^2 代表胺基之通式 (I) 化合物之製備，係使式 (IV) 化合物：



(IV)

與式 (V) 化合物反應：



(V)

此反應係在鹼例如金屬烷醇鹽較好為乙醇鈉存在下，於惰性溶劑如乙醇中在 0°C 至回流溫度間進行。

依據本發明進一步特徵，其中 R^1 ， R^2 ， R^3 ， R^4 及 X 如前述定義及其中 m 代表 1 或 2 之通式 (I) 化合物之製備可使其中 m 代表 0 或 1 之對應式 (I) 化合物氧化而得。反應較好以過酸如 3-氯過苯甲酸在惰性溶劑例如二氯甲烷中在 0°C 至溶劑回流溫度間進行。

五、發明說明 (14)

依據本發明進一步特徵，其中 R^2 代表 NR^6R^7 ， $-S(O)_nR^8$ ， $C(O)OH$ ，烷基，鹵烷基或 $-N=C(R^{10})(R^{11})$ ，其中 R^6 及 / 或 R^7 代表烷基，鹵烷基， $-C(O)R^8$ ， $C(O)OR^8$ 及 $-S(O)_qCF_3$ ；其烷基部份係視情況經一或多個 R^{12} 取代；或 R^6 與 R^7 合而形成鏈中含 4 至 6 個碳原子之二價基之通式 (I) 化合物之製備，可依據國際專利公報 WO 94/21606，WO 93/06089 及 WO 87/03781，歐洲專利公報 0295117 及 EP 511845 及 Hatton 等人之 USP 5,232,940，德國專利公報 DE 19511269 及 EP 780378 之一或多個文獻所述方法，由其中 R^2 為胺基之對應化合物而製備。

依據本發明又一特徵，其中 R^1 ， R^3 ， R^4 及 X 如前述定義及 R^2 代表 NR^6R^7 ，其中 R^6 代表氫及 R^7 代表在 2-位置經 R^{12} 取代之乙基，其中 R^{12} 代表氰基、硝基、 $-S(O)_sR^8$ 、 $C(O)R^8$ 、 $C(O)OR^9$ 、胺羰基、烷胺羰基、二烷胺羰基、胺磺醯基、烷胺磺醯基或二烷胺磺醯基之通式 (I) 化合物之製備，可使其中 R^2 為胺基之對應式 (I) 化合物與式 (VI) 化合物反應：



其中 R^{12} 如前述定義。此反應可視情況在鹼如氫化鈉、鹼金屬氫氧化物如氫氧化鉀，或氫氧化四烷銨如氫氧化 N-苳基三甲銨存在下，在溶劑如甲苯、乙醇或水中，在 $-20^\circ C$ 至回流溫度間進行。

依據本發明又一特徵，其中 R^1 ， R^3 ， R^4 及 X 如前述定義及 R^2 代表 NR^6R^7 其中 R^6 及 / 或 R^7 代表視情況經一或多個 R^{12} 取代之烷基或鹵烷基之通式 (I) 化合物之製備，可使其中 R^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 (15)

為胺基之對應式(I)化合物與式(VII)化合物反應：



其中 R^{14} 為視情況經一或多個 R^{12} 取代之烷基或鹵烷基及Y代表離去基，較好為鹵素如氯。反應係在鹼如氫氧化鉀、甲醇鉀、氫化鈉或三乙胺存在下在惰性溶劑如甲基第三丁基醚或甲苯中，在 -20°C 至回流溫度間進行。

依據本發明又一特徵，其中 R^2 代表 C(O)OR^8 之通式(I)化合物之製備，係使其中 R^2 為羧基之對應式(I)化合物與式(VIII)之醇反應：



上述反應通常係在酸觸媒如硫酸存在下，通常在過量醇存在下或視情況於輔溶劑中，在 0°C 至回流溫度間進行。或者，此反應可使用偶合劑如二環己基羰二醯亞胺(DCC)於惰性溶劑中進行。

依據本發明又一特徵，其中 R^2 代表羧基之通式(I)化合物之製備，係使其中 R^2 以甲醯基置換之對應式(I)化合物氧化。反應通常使用過錳酸鉀或鉻酸在溶劑如水中在 0°C 至回流溫度間進行。

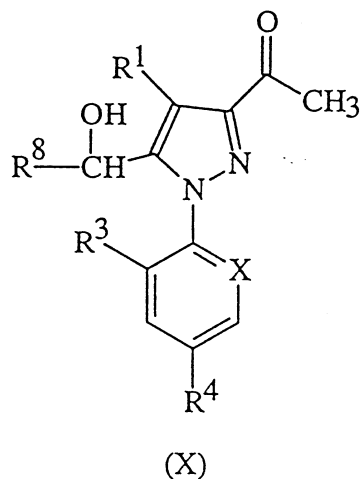
依據本發明又一特徵，其中 R^2 代表 $R^a\text{CH(Cl)CH}_2$ -且其中 R^a 代表烷基之通式(I)化合物之製備，係使其中 R^2 代表胺基之對應式(I)化合物重氮化並與式(IX)化合物反應：



此反應通常使用亞硝酸烷酯如亞硝酸第三丁酯在銅鹽如氯化銅(II)存在下，於溶劑如乙腈中，在 -10°C 至 50°C 之溫度進行。

五、發明說明 (16)

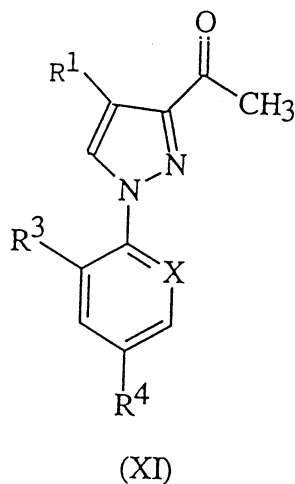
依據本發明又一特徵，其中 R^2 代表 $C(O)R^8$ 之通式(I)化合物之製備，係使式(X)之對應化合物氧化：



其中 R^1 ， R^3 ， R^4 及X如前述定義。此反應可使用例如鉻酸及硫酸之混合物，在溶劑如水及丙酮中在 0°C 至 60°C 之溫度進行。

依據本發明又一特徵，其中 R^2 代表 OR^9 之通式(I)化合物可依USP 5,047,550及4,918,085所述方法製備。

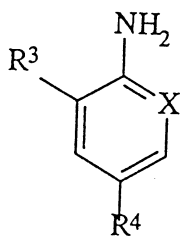
其中 R^1 代表 $S(O)_mR^5$ 且其中m代表1或2之式(II)中間物之製備，可使用上述由式(III)化合物製備式(I)化合物之方法，使式(IX)之化合物：



五、發明說明 (17)

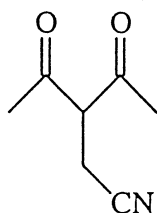
與式 $R^5S(O)_mY$ (其中 Y 代表鹵素，較好為氯) 之試劑反應。

其中 R^2 為胺基之式 (III) 中間物之製備，可使式 (XII) 化合物重氮化：



(XII)

並使所得重氮鎨鹽與式 (XIII) 試劑反應：



(XIII)

式 (XII) 化合物之重氮化反應可藉已知文獻之程序進行。重氮鎨鹽與式 (XIII) 化合物之反應而得其中 R^2 為胺基之式 (III) 化合物，可經由偶合及隨後閉環之兩步驟製程而達成，其可在相同容器進行。縮合反應可在適宜酸如乙酸或鹽酸存在下或在鹼性觸媒如乙酸钠存在下達成。反應可在各種溶劑包含醇如乙醇或醚如甲基第三丁基醚，視情況與水之混合物中，通常在約 -30°C 至 100°C 之溫度，較好在 0°C 至 50°C 之溫度進行。閉環步驟較好在鹼觸媒存在下於適宜溶劑 (包含但不限於反應第一 (偶合) 階段中所用者) 中進行。所用之鹼觸媒可為有機鹼如三乙胺或吡啶；脒類如 1,8-二吡

五、發明說明 (18)

雙環(5.4.0)十一碳-7-烯(DBU)或無機鹼如氨，碳酸氫鈉或氫氧化鈉。反應可在約 -30°C 至約 120°C ，較好自 0°C 至 100°C 進行。

式(X)中間物之製備，可使其中 R^2 經甲醯基置換之式(I)對應化合物與式 R^8Q 之有機金屬試劑反應，其中Q較好為鹼或鹼土金屬，例如鎂鹵化物(格林納)試劑。此反應可在惰性溶劑如甲基第三丁基醚中在 -78°C 至溶劑回流之溫度進行。

其中 R^2 經甲醯基置換之式(I)中間物之製備，係使其中 R^2 代表 $\text{R}^a\text{CH}=\text{CH}-$ 之對應式(I)化合物氧化。此反應通常使用如臭氧或偏過碘酸鈉之試劑，於惰性溶劑例如二氯乙烷中，在 -100°C 至 100°C 之溫度進行。

其中 R^2 以 $\text{R}^a\text{CH}=\text{CH}-$ 置換之式(I)中間物之製備，可使其中 R^2 代表 $\text{R}^a\text{CH}(\text{Cl})\text{CH}_2-$ 之對應式(I)化合物脫氯化氫而得。此反應通常使用鹼如氫氧化鈉或三乙胺在惰性溶劑如二氯乙烷中，在 -70°C 至回流溫度間進行。

通式(XII)中間化合物之合成可依據各種已知方法達成，例如述於GB 8531485及GB 9201636以及Hatton等人之USP 5,232,940者。

某些式(II)化合物為新穎且因而形成本發明又一特徵。

式(IV)及(V)中間物為已知或可以已知方法製備。

本發明以下列實例加以說明，其不視為限制本發明，僅為更佳之使用例。

實例 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 (19)

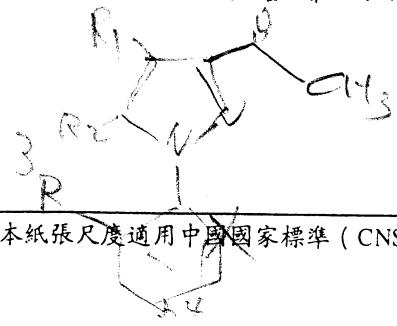
於含 1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-5-胺基-3-氟基-4-甲基亞磺醯基吡啶(2克)之甲苯懸浮液中，添加溴化甲基鎂(7毫升之於甲苯/THF之1.4M溶液)。混合物在 20°C 攪拌(1小時)並以飽和氯化銨溶液中中和。有機層經乾燥(硫酸鈉)、蒸發且殘留物以層析法使用含 40% 乙酸乙酯之己烷純化，得 3-乙醯基-5-溴-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞磺醯基吡啶(化合物 1，0.68克)，m.p. 166°C。

以類似方法，得下表所示之式(I)化合物。表中，Et 表示乙基。

化合物 編號	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	m.p. °C
2	SCH ₃	NH ₂	Cl	CF ₃	C-Cl	113
3	SOEt	NH ₂	Cl	CF ₃	C-Cl	189
4	SOCH ₃	NHEt	Cl	CF ₃	C-Cl	123
5	SOCH ₃	NHCH ₃	Cl	CF ₃	C-Cl	126
6	SOCH ₃	NHCH ₂ CONH ₂	Cl	CF ₃	C-Cl	165
7	SOCH ₃	NH(CH ₂) ₂ SO ₂ Et	Cl	CF ₃	C-Cl	102
8	SOCH ₃	NH(CH ₂) ₂ CONH ₂	Cl	CF ₃	C-Cl	132
9	SOCH ₃	NH ₂	Br	CF ₃	C-Cl	153
11	SOCH ₃	NH ₂	Cl	SF ₅	C-Cl	166
12	SCH ₃	NH ₂	Cl	SF ₅	C-Cl	150

實例 2

於含 3-乙醯基-5-胺基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞磺醯基吡啶(3克)之含二異丙基乙胺之二氯甲烷(1.44毫升)溶液中，在 -30°C 下添加三氟甲基氧硫氣。混合物予以攪拌(2小時)且在 20°C 時吹入氮氣。添加水並乾燥有機相(硫酸鈉)並蒸發。殘留物以矽膠層析法以含 25% 乙酸乙酯之己烷溶離而純化，得 3-乙醯基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲



經濟部中央標準局員工消費合作社印製

(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)

基苯基)-4-甲基亞磺醯基-5-三氟甲基氧硫醯基胺基吡唑
(化合物 10, 0.5 克), m.p. 67-102°C, 質譜分析 $M^+/e=499$ 。

參考例 1

於含 5-胺基-3-氟基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-乙硫
基吡唑(22.25 克)之甲醇溶液中添加含硫酸(1.5 克)之異丙醇
溶液。添加過氧化氫(6.95 克之 30% 水溶液)且溫度升至 60
°C。2 小時後, 反應予以過濾且固體以甲醇洗滌。濾液經
洗滌(水洗)、乾燥並再結晶(甲醇), 得 5-胺基-3-氟基-1-
(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-乙基亞磺醯基吡唑(18.4
克), m.p. 173-174°C。

參考例 2

於含 1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-3-氟基-4-甲基亞磺醯
基-5-[1-甲氧基(仲乙亞胺基)]吡唑(6 克)之甲醇溶液中,
在 20°C 下以 15 分鐘分三批加入硼氫化鈉(0.79 克)並在氮氣
中攪拌 45 分鐘。混合物經蒸發且殘留物以矽膠快速管柱
層析, 使用含 15% 乙酸乙酯之二氯甲烷溶離而純化, 得 1-
(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-3-氟基-5-乙胺基-4-甲基亞磺醯
基吡唑(1.1 克), m.p. 130-131°C(分解)。

參考例 3

於含 5-胺基-1-(2,6-二氯-4-五氟硫苯基)-3-氟基-4-甲硫基
吡唑(20 毫克)之甲醇溶液中, 添加硫酸/異丙醇觸媒溶液
(0.02 毫升), 接著在 4°C 添加 30% 過氧化氫(0.02 毫升)。混
合物在 20°C 攪拌 2 天。再添加 H_2SO_4 /異丙醇溶液及過氧化
氫, 混合物攪拌隔夜並分配於二氯甲烷及水之間。有機層

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (21)

以亞硫酸氫鈉溶液、碳酸氫鈉溶液及水洗滌，有機層經乾燥(硫酸鈉)，蒸發且殘留物以製備性TLC使用含70%乙酸乙酯之己烷而純化，得5-胺基-1-(2,6-二氯-4-五氟硫苯基)-3-氟基-4-甲基亞磺基吡唑。H-1 NMR(CDCl₃) : 7.8 ppm (2H, d), 3.0 ppm(3H, s)。

參考例 4

I) 甲基氧硫氯之製備：

硫醯氯(1.48克)添加至含二甲基二硫化物(3.16克)之甲基第三丁基醚溶液中，混合物在20°C攪拌5小時。於下列反應中使用0.6毫升部份之所得溶液。

II) 甲基氧硫化反應：

5-胺基-1-(2,6-二氯-4-五氟硫苯基)-3-氟基吡唑(40毫克)於甲基第三丁基醚中在惰性氣體中加熱回流。添加甲基氧硫氯(0.6毫升之於甲基第三丁基醚溶液)且混合物加熱回流(4小時)。冷卻之混合物分配於飽和碳酸氫鈉與二氯甲烷間，有機層經洗滌(水洗)、乾燥(硫酸鈉)，蒸發且殘留物以製備性TLC使用含40%乙酸乙酯之己烷而純化，得5-胺基-1-(2,6-二氯-4-五氟硫苯基)-3-氟基-4-甲硫基吡唑。

H-1 NMR(CDCl₃) : 7.8 ppm(2H, s), 2.3 ppm(3H, s)。

參考例 5

含5-胺基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-3-氟基-4-甲基亞磺基吡唑(1.0克)之無水DMF溶液在10分鐘內在4°C下添加至含氫化鉀(0.7克之35%油懸浮液)之無水DMF中，並攪拌20分鐘。在4°C以5小時內添加含乙烯基乙基砒(3.13克)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (22)

之無水DMF且混合物攪拌隔夜同時在氮氣中溫至20℃。混合物再冷卻，添加氯化銨溶液，且有機層經洗滌(水洗)、乾燥(硫酸鈉)並蒸發。殘留物經結晶(乙酸乙酯/己烷)，得1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-3-氰基-5-(2-乙磺醯基乙胺基)-4-甲基亞磺醯基吡唑(4.08克)，m.p. 131-132℃。

實例1中所用之通式(II)中間物3-氰基吡唑衍生物為已知或可選擇適當反應物以適當反應式，如述於EP 0295117及USP 5,232,940般製備且示於下表，其中Et表示乙基。

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	m.p. °C
SCCH ₃	NHCH ₃	Cl	CF ₃	C-Cl	147-150
SOCH ₃	NHCH ₂ CONH ₂	Cl	CF ₃	C-Cl	155-157
SOCH ₃	NH(CH ₂) ₂ CONH ₂	Cl	CF ₃	C-Cl	159-160
SOCH ₃	NH ₂	Br	CF ₃	C-Cl	150-151

下列測試方法為哺乳類毒性之代表例。以家蠅頭取代兔腦進行之類似測試為昆蟲毒性之代表例。

GABA受體測試

兔腦以生理食鹽水(與兔子血漿相同pH)均質化。0.1毫升此懸浮液與放射性配位體[4'-乙炔基-4-正丙基雙環鄰苯甲酸酯(EBOB)]混合。含此混合物及測試化合物之試管與參考組(含此混合物但不含測試化合物)比較。

培育所有試管(90分鐘；20℃)。過濾內容物並測定濾紙上殘留之放射活性。抑制50%之經控制結合之測試化合物濃度為化合物之IC₅₀。

放射配位體結合至已知GABA受體槽道內之位置。若無測試化合物，則結合有放射配位體；若在相同位置有毒性化合物，則由於放射配位體被測試毒性化合物置換因此放

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (23)

射配位體量減少。

上述對 GABA 受體槽道之活體內測試中，本發明化合物在非常高濃度具活性(高 IC₅₀)，其顯示本化合物在對昆蟲有毒性時，對哺乳類仍具安全性。下列測試化合物使用前述製備之本發明代表性化合物。使用下列物種：

屬，種	俗名	簡寫
棉蚜(Aphis gossypii)	棉葉蚜蟲	APHIGO
麥二岔蚜(Schizaphis graminum)	麥二岔蚜	TOXOGR
家蠅(Musca domestica)	家蠅	MUSCDO
花生根結線蟲(Meloidogyne incognita)	花生根結線蟲	MELGIN

土壤浸透方法

於盆中種植棉及蜀黍。處理前一天，各盆以約 25 隻蚜蟲混合繁殖感染。棉植物以棉葉蚜蟲感染及蜀黍植物以麥二岔蚜感染。測試化合物以可對土壤輸送 20，5 及 1.25 ppm 重量濃度之溶液施加至土壤表面，在 5 DAT(處理後天數)得蚜蟲數。比較經處理植物上之蚜蟲數與未處理對照組植物上之蚜蟲數。

化合物編號 1-12 在 2.5 ppm 或更低劑量呈現對棉蚜之有效防治，化合物 1-7 及 9-12 在 2.5 ppm 或更低劑量呈現對麥二岔蚜之有效防治。

線蟲土壤浸透法

土壤以測試化合物處理得 10.0 ppm 之土壤濃度。自受感染之蕃茄根部收集及分離之幼蟲誘入經處理土壤中。經處理且以線蟲感染之土壤內植以蕃茄種子或棉種子(兩者均

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

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 (24)

易受線蟲侵襲)。植物生長及形成根結之適宜間隔後，植物自土壤移走並對根結形成檢視根部。未處理未接種之植物根部無根結，顯示測試化合物具高活性。

家蠅誘餌/接觸測試

使約25隻4至6天齡家蠅成蟲麻醉並置於含測試化合物之糖水誘餌溶液之籠中，誘餌溶液中化合物濃度為100 ppm。24小時後，在刺激下仍無移動之家蠅視為死亡。

以本發明代表性化合物得100%致死率。

本發明提供一種組織性防治節肢動物之方法，尤其是某些在植物地面上部份覓食之昆蟲或蟲。防治此種葉面害蟲可直接以葉面施用或對土壤施以噴霧或植以顆粒至植物根部或植物種子，隨後組織性地移至植物地面上部份。此種組織性活性包含防治不僅駐留在施用處亦駐留在遠離植物側之昆蟲，例如由葉之一側移至另一側或由經處理葉移至未處理葉者。可組織性地由本發明化合物防治之有害昆蟲種類例如等翅目級(Homoptera)(刺吸類)、半翅目(Hemiptera)級(刺吸類)及纓翅目(Thysanoptera)等級。本發明尤適用於蚜及牧草蟲。

由前述殺蟲用途可看出，本發明提供殺蟲活性之化合物及使用該化合物用以防治數種害蟲之方法，該害蟲包含：節肢動物，尤其是昆蟲或恙蟲類；植物線蟲類；或寄生蟲或原生害蟲。因此式(I)化合物或其殺有害生物可接受性鹽可有利地用於實際用途，例如用於農業或園藝作物，林業，獸醫醫藥或家畜農作，或用於公共衛生。由此點來

五、發明說明 (25)

看，本文所用之"式(I)化合物"包含式(I)化合物及其殺害生物可接受性鹽。"式(I)化合物"包括式(I)化合物及其殺有害生物可接受性鹽。

因而本發明提供一種在區域上防治有害生物之方法，包括以有效量之式(I)化合物或其殺有害生物可接受性鹽處理該區域(例如藉塗佈或投藥)，其中各取代基如前述定義。該區域包含例如，害蟲本身或害蟲駐留或取食之地區(植物、動物、因地、結構、房地、森林、果園、水道、土壤、植物或動物產品等)。

本發明化合物除了用以防治土壤昆蟲如玉米根蟲、白蟻(尤用以防護結構)、根蛆、叩頭蟲幼蟲、根象皮蟲、莖穿孔蟲、糖蛾、根蚜蟲或蛆幼蟲，其亦可用以對植物提供抗致病性線蟲之活性，如根結蟲、膿胞、dagger、組織障礙、或莖或球線蟲，或防治恙蟲。就防治土壤害蟲例如玉米根蟲而言，化合物可有利地以有效比率施用或併入其中已植有植物或欲植入植物或種子或使植物生長之土壤中。

在公共衛生領域中，此化合物尤可用以防治許多昆蟲，尤其是不潔之蠅類或其他雙翅目(Dipteran)昆蟲，如家蠅、廐蠅，水虻，角蠅，鹿蠅，馬蠅，蚋，大蚊，黑蠅或蚊子等。

本發明化合物可用於下列應用及下列害蟲，包含節肢動物，尤其是昆蟲或恙蟲、線蟲或寄生蟲或原生昆蟲：

在貯存產品例如穀類包含穀物或麵粉，落花生，動物飼料，木材或家用產品如毛毯及織物之防護中，本發明化合

(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)

物可用以抗節肢動物尤其是甲蟲，包含象皮蟲，蛾或恙蟲之侵襲，例如粉螟屬 (Ephestia spp.) 皮蠹屬 (Anthrenus spp.) (紅綠皮蠹)，擬谷盜屬 (Tribolium spp.)，象谷屬 (Sitophilus spp.) 或粉蟎屬 (Acarus spp.)。

用於受感染家禽或工業房屋中防治蜘蛛，蟻或白蟻或類似節肢動物，或用於水道、水井、貯槽或其他流動或靜止水中防治蚊幼蟲。

用於處理基礎結構或土壤以防護建築受白蟻例如白蟻屬 (Reticulitermes spp.)，Heterotermes 屬，家白蟻屬 (Coptotermes spp.) 之侵襲。

於農業中抗鱗翅目(蝴蝶及蛾)之成蟲、幼蟲及卵，如夜蛾屬 (Heliothis)，如美洲菸夜蛾 (Heliothis virescens)，棉鈴蟲 (Heliothis armigera) 及美洲棉鈴蟲 (Heliothis zea.)；抗鞘翅目(甲蟲)之成蟲及幼蟲，如象甲屬 (Anthonomus spp.)，如棉鈴象甲 (grandis)，馬鈴薯甲蟲 (Leptinotarsa decemlineata)，葉甲屬 (Diabrotica spp.) (玉米根蟲)；抗異翅亞目(半翅目及同翅目)，如木虱屬 (Psylla spp.)，粉虱屬 (Bemisia spp.)，白粉虱 (Trialeurodes spp.)，蚜 (Aphis spp.)，額蚜屬 (Myzus spp.)，蠶豆修尾蚜 (Megoura viciae)，瘤蚜屬 (Phylloxera spp.)，葉蟬屬 (Nephotettix spp.) (黑尾葉蟬)，褐稻虱屬 (Nilaparvata spp.)；

抗雙翅目如家蠅屬 (Musca spp.)，抗纓翅目如煙草薊馬 (Thrips tabaci.)；抗直翅目如飛蝗 (Locusta) 反美洲蚱蜢 (Schistocerca spp.)，(飛蝗及蟋蟀)，如蟋蟀屬 (Gryllus spp.)

五、發明說明 (27)

及黑蟋蟀屬 (Acheta spp.)，例如東方蜚蠊 (Blatta orientalis)，美洲大蠊 (Periplaneta americana)，德國小蠊 (Blatella germanica) 亞洲飛蝗 (Locusta migratoria migratorioides) 及 Schistocerca gregaria；抗彈尾目 (Collembola) 如大蠊屬 (Periplaneta spp.) 及小蠊屬 (Blattella spp.) (蜚蠊)；抗等翅目如白蟻屬 (Coptotermes spp.)；

抗農業上重要之節肢動物如蟎 (Acari) 例如葉蟎屬 (Tetranychus spp.) 及紅蜘蛛屬 (Panoychus spp.)；

抗會直接侵襲農業、林業或園藝上重要之植物或樹木或因植物之撒佈細菌、病毒、細菌原生質之真菌疾病而侵襲植物或樹木之線蟲類。例如根結線蟲如根結線蟲 (Meloidogyne spp.) (如 M. incognita)。

用於獸醫藥或家畜農事或維持公共衛生，以抗節肢動物、寄生蟲或原生動物，其係內部或外部寄生於脊椎動物尤其是溫血脊椎動物上，例如飼養動物如牛、羊、山羊、馬、豬、家禽、狗或貓，例如蜱蟎 (Acarina)，包含蜱類 (如羊硬蜱屬 (Ixodes spp.)，牛蜱屬 (Boophilus spp.)，如微小牛蜱 (Boophilus microplus)，血紅扇頭蜱屬 (Rhipicephalus spp.)，如 Rhipicephalus appendiculatus，喙蜱屬 (Ornithodoros spp.) (如耳殘喙蜱 (Ornithodoros moubata) 及蟎類 (如 Damalinia 屬)；雙翅目 (如伊蚊屬 (Aedes spp.)，按蚊屬 (Anopheles spp.)，家蠅屬 (Musca spp.)，皮蠅屬 (Hypoderma spp.)；半翅目；網翅目 (如大蠊屬 (Periplaneta spp.)，小蠊屬 (Blatella spp.)；膜翅目，例如抗由寄生性線蟲引起之胃

(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)

腸道感染，例如毛狀圓蟲(Trichostrongylidae)；用於防治及治療由例如球蟲(Eimeria)屬，如南美錐蟲(Trypanosoms cruzi)，萊什曼原蟲(Leishaminia)屬，原形蟲(Plasmodium)屬，巴貝斯蟲(Babesis)屬，滴蟲(Trichomonadidae)屬，毒漿體原蟲(Toxoplasma)屬及泰勒蟲(Theileria)屬引起之原生性疾病。

在用以防治節肢動物，尤其是昆蟲或恙蟲類或植物之線蟲害蟲之實際用途中，該方法包括對植物或對其生長之周圍施用有效量之本發明化合物。對此方法而言，對欲防治節肢動物或線蟲感染之區域，通常以每公頃欲處理之區域使用約5克至約1公斤之活性化合物之有效率施用該活性化合物。在理想狀況下，視欲防治之害蟲而定，較低比率亦可提供適當之防護作用。另一方面，因不良天候狀況、害蟲之抗性或其他因素而可能需使用較高比例之活性成分。最適比例一般視數種因素而定，例如欲防治害蟲之種類，受感染植物之種類或生長階段，施用之樹列或方法而定。更好活性化合物之有效率為約50克/公頃至約400克/公頃。

當害蟲係在土壤中生長，活性化合物通常係於調配組合物中以任何便利方式均勻分佈於欲處理區域(例如以撒佈或波段處理)且係以約5克至約1公斤活性成分/公頃，較好約50至約250克活性成分/公頃之比例施用。當以根浸漬至幼苗或灌溉至植物中而施用時，液體溶液或懸浮液含有約0.0075至約1000毫克活性成分/升。較好約25至約200毫克

五、發明說明 (29)

活性成分/升。若需要，可施用至田地或作物生長區域或約略靠近欲保護免受侵襲之種子或植物上。活性成分可藉水噴霧洗入土壤之整個區域中或可藉雨水之自然作用洗入。施用期間或施用後，若需要，調配之化合物可機械地分佈於土壤中，例如犁田、耙田或使用施拖鏈。施用可在種植前、種植時、種植後進行，亦可在發芽前或發芽後進行。

本發明化合物及防治有害生物之方法尤可用於田地、牧草，農園，溫室，果園或葡萄農作物之防護作用，裝飾物，或農園或林樹之防護作用，例如：穀類(如小麥或稻)，棉花，蔬菜(如胡椒)，田農作物(如甜菜，大豆或油菜籽)、牧草或糧草作物(如玉米或蜀黍)，果樹或小樹林(如種子或核類水果或柑橘)，裝飾性植物，溫室或花園中之花或蔬菜或灌木，或林樹(落葉性及常綠性兩種)，農園或苗圃。

其亦可用以保護樹木(直立的、砍倒的、加工的、貯存的或結構的樹木)免受例如鋸蠅或甲蟲或白蟻之侵襲。

其可應用於保護貯存之產品如穀物、水果、核桃、香料或煙草，無論係整體、研磨或混合或產品者，免受蛾、甲蟲、恙蟲或穀類象皮蟲之侵襲。亦可用以防護貯存之動物產品如天然或加工之皮革、毛髮、羊毛或羽毛(如呈毛毯或織物態)免受蛾或甲蟲之侵襲及用以防護貯存之肉類、魚或穀類免受甲蟲、恙蟲或蒼蠅侵襲。

此外，本發明化合物及其使用方法特別可用以防治節肢動物、寄生蟲或原生動物，其係對例如前述之家禽動物具

(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)

損害或散佈或作為媒介之作用，且尤其可用以防治扁虱、恙蟲、蝨、蚋或蚊或蒼蠅。本發明化合物尤可用於防治存在於家禽宿主動物體內或於皮膚內或皮膚上取食或吸取動物血液之節肢動物、寄生蟲或原生動物，就此目的而言可以口服、非經腸道、經皮或局部投藥。

再者，本發明化合物可用於球蟲屬之原生寄生蟲感染所引起之球蟲病疾病。此為家禽動物及鳥類，尤其是在密集狀態下飼養之動物中經濟流失之潛在肇因。例如可影響牛、羊、豬或兔子，但此疾病於家禽尤其是雞特別重要。在預防或大為降低球蟲病之發生可投與少量之本發明化合物，較好與飼料一起投與。此化合物有效地抗盲腸型式及腸內型式兩者。再者，本發明化合物亦可藉大為減少所產生之卵母細胞之數目及芽胞而對其展現抑制作用。此種家禽性疾病通常係藉鳥類攜帶感染有機體並掉入或污染巢廄、地面、食物或飲水而散佈。此疾病顯現出血、盲腸中血液蓄積、血液流失、變弱及消化性障礙。此疾病經常使動物死亡，但仍存活之受感染家禽則因感染結果而喪失其市場價值。

後述之用於作物生長或作物生長部位或作為種子肥料之此組合物通常可對動物局部施用或用以保護貯存產品、家用物品或一般環境品質或地區。本發明化合物之適宜施用方式包含：

使作物生長，以葉面噴霧、撒粉、顆粒劑、霧劑或泡沫劑施用，或以細粒或包囊組合物之懸浮液以液體浸泡、撒

(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)

粉、顆粒、煙霧或泡沫劑對土壤或根部處理；藉液體漿液或粉塵劑經由作為種子胞料而施用至作物種子；

對受節肢動物、寄生蟲或原生動物感染或可受其感染之動物，以非經腸道、口服或局部施用其中活性成份在長期間內對節肢動物、寄生蟲或原生動物展現中度及/或延長活性之組合物，例如併入飼料中或呈適宜之口服攝取醫藥配方，可食性餌、鹽舐劑、飲食補充劑、澆淋配方、噴霧劑、浴劑、浸漬劑、淋劑、噴劑、粉塵劑、油劑、洗髮精、乳霜、蠟塗劑或家畜自我處理系統；

用於一般環境或害蟲可潛伏之特定區域，包含貯存產品，木材，家用產品或家用或工業房屋；以噴霧劑、霧劑、粉塵劑、煙霧劑、蠟塗劑、漆劑、顆粒劑或餌劑施用，或慢慢飼入水道、水井、貯槽或其他流動或靜止水中；

用於飼養動物飼料中以防治覓食其排泄物之蒼蠅幼蟲。

實務上，本發明化合物最經常形成組合物之一部份。該等組合物可用以防治：節肢動物，尤其是昆蟲或恙蟲；線蟲；或寄生或原生性害蟲。該組合物可為本技藝中已知適用於任何房屋或室內或戶外區域或以內部或外部投藥至脊椎動物之任何型式。該等組合物含有至少一種式(I)化合物或其殺有害生物可接受性鹽(如前所述)作為活性成分，而與一或多種其他可相容成分例如固體或液體載體或稀釋劑，佐劑、表面活性劑等適用於所需用途且為農藝或醫藥可接受性成分組合。同樣地，可以本技藝任何已知方式製

(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)

備之該等組合物亦為本發明之一部份。

該等組合物亦可含有其他種類之成分如保護性膠體、黏著劑、增稠劑、觸變劑、滲透劑、噴霧油劑(尤指恙蟲用途)、安定劑、保存劑(尤指鑄模保存劑)、多價螯合劑及其他具殺蟲性質(尤指殺昆蟲、殺恙蟲、殺線蟲或殺真菌性質)或具調節植物生長性質之活性成分。更通常，本發明所用化合物可與所有相當於配方尋常技術之固體或液體添加劑組合。

適用於農業、園藝等之組合物包含適合作為例如噴霧劑、粉塵劑、顆粒劑、霧劑、泡沫劑、乳液劑等之配方。

本發明所用化合物之有效使用劑量可在廣範圍內變化，尤其視欲消除之害蟲天質或作物受該等害蟲感染程度而異，通常，本發明組合物含有約0.05至約95%(重量)之一或多種本發明活性成分，約1至約95%之一或多種固體或液體載體，及視情況之約0.1至約50%之一或多種其他可相容成分如表面活性劑等。

本發明中，"載體"一詞表示可與活性成分組合而有利於其施用至例如植物、種子或土壤之有機或無機成分、天然或合成成分。因此此載體通常為惰性且需為可接受者(例如農業可接受、尤指經處理植物可接受者)。

載體可為固體，例如黏土，天然或合成矽酸鹽，矽石，樹脂，蠟、固體肥料(例如銨鹽)，天然礦物如高嶺土，黏土，滑石，白堊，石英，綠坡縷石，蒙脫土，膨潤土或矽藻土或合成礦物如矽石，氧化鋁或矽酸鹽，尤其是矽酸鋁

(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)

或鎂。用於顆粒劑之固體載體宜為下列：粉碎或分級之天然岩石如方解石、大理石、浮石、海泡石及白雲石；無機或有機粉之合成顆粒；有機材料之顆粒如鋸屑、椰子殼、玉米穗、玉米殼或煙草莖；矽藻土，磷酸三鈣，粉化之軟木塞，或吸附性碳黑；水溶性聚合物，樹脂，蠟；或固體肥料。此種固體組合物若需要可含有一或多種可相溶之溼潤劑、分散劑、乳化劑或著色劑，其當為固體時亦可作為稀釋劑。

此載體亦可為液體，例如：水、醇類、尤其是丁醇或二醇，及其醚類或酯類，尤其是甲基二醇乙酸酯；酮類尤其是丙酮、環己酮、甲基乙基酮、甲基異丁基酮或異佛爾酮、石油餾份如鏈烷或芳族烴類，尤其是二甲苯或烷基萘；礦油或植物油；脂族氯化烴，尤其是三氯乙烷或二氯甲烷；芳族氯化烴，尤其是氯苯；水溶性或強極性溶劑如二甲基甲醯胺、二甲基亞砷、或N-甲基吡咯酮；液化氣；或其混合物。

表面活性劑可為離子或非離子型之乳化劑、分散劑或溼潤劑或此種表面活性劑之混合物。其中，其為例如聚丙烯酸鹽，木質磺酸鹽、酚磺酸或萘磺酸鹽，環氧乙烷與脂肪醇或脂肪酸或脂肪酯或脂肪胺之聚縮合物，經取代酚（尤其是烷基酚或芳基酚），磺基琥珀酸酯鹽，牛磺酸衍生物（尤其是烷基牛磺酸酯），醇或環氧乙烷與酚之聚縮合物之磷酸酯，脂肪酸與多元醇之酯，或前述化合物之硫酸根、磺酸根或磷酸根官能基衍生物。當活性成分及/或惰性載

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

線

五、發明說明 (34)

體僅略水可溶或水不溶且組合物之載體為水時，通常必須存在有至少一種表面活性劑。

本發明組合物又可含有其他添加劑如黏著劑或著色劑。配方中可使用黏著劑如羧甲基纖維素或呈粉狀、粒狀或膠乳狀之天然或合成聚合物，如阿拉伯膠、聚乙烯醇或聚乙烯乙酸酯、天然磷脂質如腦磷脂或卵磷脂，或合成磷脂質。亦可使用著色劑如無機顏料，例如氧化鐵、氧化鈦或普魯士藍；有機染料如茜素染料、偶氮染料或金屬酞花青染料；或微量營養物如鐵、錳、硼、銅、鈷、鉬或鋅之鹽。

可用以防治節肢動物、植物線蟲、寄生性或原生性害蟲之含有式(I)化合物或其殺有害生物可接受性鹽之組合物亦可含有協同劑(如胡椒基丁氧化物或芝麻糊)、安定化物質、其他殺蟲劑、殺蟎劑、殺植物線蟲劑、抗寄生蟲或抗球蟲劑、殺真菌劑(若適宜可為農業用或獸醫用，如班莫明(benomyl)及衣普酮(iprodione))，殺菌劑、節肢動物或脊椎動物誘引或排斥劑或費洛蒙，除臭劑、矯味劑、染料或輔助治療劑，如微量元素。其他設計成改良效力、持久性、安全性，若需要之安全性、害蟲防治圖譜或使組合物於相同處理動物或區域中進行有用之功能。

可包含於或可用以組合於本發明組合物中之其他殺蟲活性化合物實例為：好勝(acephate)、氯吡氟(chlorpyrifos)、大滅通-S-甲基(demeton-S-methyl)、二硫酮(disulfoton)，乙普氟(ethoprosfos)，費托松(fenitrothion)，費明福

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (35)

(fenamiphos)，福納氟(fonofos)，異吡福(isazophos)，異芬福(isofenphos)，馬來松(malathion)單可體福(monocrotophos)巴拉松(parathion)，佛瑞特(phorate)，福殺隆(phosalone)，吡嘧福-甲基(pirimiphos-methyl)，特佈氟(terbufos)三唑福(triazophos)西福靈(cyfluthrin)，西普滅靈(cypermethrin)，代特滅靈(deltamethrin)芬普帕靈(fenpropathrin)，芬巴拉特(fenvalerate)，普滅靈(permethrin)，帖氟靈(tefluthrin)，吡迪卡(aldicarb)，卡硫芬(carbosulfan)，滅索明(methomyl)，歐殺明(oxamyl)，吡嘧卡(pirimicarb)，苯地卡(bendiocarb)，泰佈隆(teflubenzuron)，地可佛(dicofol)，印哧硫芬(endosulfan)，琳丹(lindane)，苯肱滅(benzoximate)，培丹(cartap)，賽亥殺汀(cyhexatin)，四地風(tetradifon)，阿波美汀(ivermectins)，依波美汀(ivermectins)，密班黴素(milbemycins)，硫芬耐(thiophanate)，三氯風(trichlorfon)，二氯波(dichlorvos)，二波啉(diaveridine)或二滅三嗪(dimetriadazole)。

就其農業應用而言，式(I)化合物或其殺有害生物可接受性鹽因此通常係呈組合物態，可為各種固體或液體態。

可使用之固體態組合物為撒佈粉(式(I)化合物或其殺有害生物可接受性鹽之含量達至80%)，可溼性粉末或顆粒(包含水可分散顆粒)，尤其是由粉末(該等可溼性粉末或顆粒中，式(I)化合物或其殺有害生物可接受性鹽之含量為約0.5至約80%間)經擠出、壓實、浸漬顆粒載體或令其造粒所得者。含一或多種式(I)化合物或其殺有害生物可

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (36)

接受性鹽之固體均相或非均相組合物，例如顆粒、丸粒、硬固燃料或膠囊可用以長時間處理靜止水或流動水。使用本文所述之水可分散性濃縮物慢慢饋入或間歇性蝕入亦可達類似效果。

液體組合物包含例如水性或非水性溶液或懸浮液(如可乳化濃縮物，乳液，可流動劑、分散液或溶液)或氣溶膠。液體組合物尤其亦包含可乳化濃縮物，分散液，乳液，可流動劑，氣溶膠，可溼性粉末(或噴霧用粉末)，乾狀可流動劑或糊膏，該組合物係呈液體或在施用時欲形成液體組合物而以水性噴霧劑(包含低及超低容積)或以霧或氣溶膠施用。

呈可乳化或可溶性濃縮物態之液體組合物最常包括約5至約80%重量之活性成分，而已可供施用之乳液或溶液依個例，含有約0.01至約20%之活性成分。除了溶劑以外，可乳化或可溶性濃縮物若需要可含有約2至約50%之適宜添加劑，如安定劑、表面活性劑、滲透劑、腐蝕抑制劑，著色劑或黏著劑。特別適宜施用至例如植物之任何所需濃度之乳液可由該等濃縮物以水稀釋而得。該等組合物亦包含於本發明所用之組合物範圍內。此乳液可呈油包水或水包油態且其可具有濃稠度。

本發明液體組合物除了正常之農業用途以外，可用於例如受節肢動物(或以本發明化合物防治之其他害蟲)感染或易受其感染之基材或部位，包含房屋，戶外或室內貯藏或加工區，容器或設備或靜止水或流動水。

五、發明說明 (37)

所有該等分散液或乳液或噴霧混合物可以任何適宜方式施用至作物上，如以通常每公頃約100至約1,200升噴霧混合物之比例簡單噴霧，但亦可用較高或較低比例(如低或超低容積)，視需求或施用技術而定。本發明化合物或組合物係便利地施用至植物，尤其是具有欲消除之害蟲之根或葉上。本發明化合物或組合物之另一種施用方法為化學移動法，亦即於灌溉水中添加含活性成分之配方。此灌溉可為對葉面撒水灌溉殺有害生物劑或可以地面或地下灌溉至土壤中或用於組織性之殺有害生物劑。

可藉噴霧施用之濃縮懸浮液係製備成產生不沈降之安定流體產物(細研磨者)且通常含約10至約75%重量之活性成分，約0.5至約30%表面活性劑，約0.1至約10%觸變劑，約0至約30%適宜添加劑，如消泡劑，腐蝕抑制劑，安定劑，滲透劑，黏著劑及作為載體之水或有機液體(其中活性成分係難溶或不溶者)。某些有機固體或無機鹽可溶於載體中助於避免沈降或作為水之抗凍劑。

可溼性粉末(或噴霧用粉末)一般係製備成含有約10至約80%重量活性成分，約20至約90%固體載體，約0至約5%溼潤劑，約3至約10%分散劑及若需要之約。至約80%之一或多種安定劑及/或其他添加劑，如滲透劑，黏著劑，抗結塊劑，著色劑等。為了獲得該等可溼性粉末，活性成分於適宜摻合機中與可浸潤於多孔填料上之額外物質充分混合並使用研磨機或其他適宜碾磨機研磨。此可產生可溼性粉末，其溼潤性及懸浮性較有利。其可懸浮於水中而得任

(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)

何所需濃度且此懸浮液尤其可有利地使用於植物葉面。

"水可分散性顆粒(WG)"(易分散於水中之顆粒)具有實質上接近於可溼性粉末之組成。其可藉由使可溼性粉末所述之配方以溼式路徑(使細粒活性成分與惰性填料及少量水如1至20%重量接觸,或與分散劑或黏合劑之水溶液接觸,再乾燥並過篩)或以乾式路徑(密實化後研磨並過篩)予以造粒而製備。

調配之組合物之比例及濃度可依據施用方法或組合物性質或其用途而異。概言之,用以防治節肢動物、植物線蟲、寄生性或原生性害蟲之組合物一般含有約0.00001%至約95%,更特別是約0.0005%至約50%重量之一或多種式(I)化合物或其殺有害生物可接受性鹽,或所有活性成分(亦即式(I)化合物或其殺有害生物可接受性鹽與其他對節肢動物或植物線蟲有毒性之物質、抗寄生蟲劑、抗球蟲劑、協同劑,微量元素或安定劑之總和)。所用之確實組成及施用比例係由農夫、畜牧類製造者、醫藥或獸醫調配者、害蟲防治操作者或本技藝之其他人員加以選擇以達所需效果者。

局部施用於動物、木材、貯存產品或家用用品之固體或液體組合物一般含有約0.00005%至約90%,更特別是約0.001%至約10%重量之一或多種式(I)化合物或其殺蟲可接受性鹽。就對動物口服或非經腸道投藥而言,包含經皮之固體或液體組合物,其一般含有約0.1%至約90%重量之一或多種式(I)化合物或其殺有害生物可接受性鹽。醫療性

五、發明說明 (39)

飼料一般含有約0.001%至約3%重量之一或多種式(I)化合物或其殺有害生物可接受性鹽。用以與飼料混合之濃縮物或增補劑一般含有約5%至約90%，較好約5%至約50%重量之一或多種式(I)化合物或其殺有害生物可接受性鹽。無機鹽舐劑一般含有約0.1%至約10%重量之一或多種式(I)化合物或其殺有害生物可接受性鹽。

施用於家畜類、物品、房屋或戶外之撒粉或液體組合物可含有約0.0001%至約15%，更特別是約0.005%至約2.0%重量之一或多種式(I)化合物或其殺有害生物可接受性鹽。於處理水中適宜濃度為約0.0001 ppm至約20 ppm，更特別是約0.001 ppm至約5.0 ppm之一或多種式(I)化合物或其殺有害生物可接受性鹽，且可以適宜曝露次數用以治療漁場。可食物餌可含有約0.01%至約5%，較好約0.01%至約1.0%重量之一或多種式(I)化合物或其殺有害生物可接受性鹽。

當以非經腸道、口服或經皮或其他方式對脊椎動物投藥時，式(I)化合物或其殺有害生物可接受性鹽之劑量將視脊椎動物之種類、年齡或健康及視受節肢動物、寄生性或原生性害蟲之確實或潛在感染程度及性質而異。口服或非經腸道投藥宜為動物每公斤體重約0.1至約100毫克，較好約2.0至約20.0毫克之單一劑量，或動物每公斤體重每日約0.01至約20.0毫克，較好約0.1至約5.0毫克劑量持續醫療。藉由使用持釋性配方或裝置，可組合一個月期之所需日劑量並以單一瞬間對動物投藥。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

五、發明說明 (40)

下列組合物實例2A-2M說明用以抗節肢動物，尤其是恙蟲或昆蟲、植物線蟲或寄生性或原生性害蟲之組合物，其包括製備例中所述之式(I)化合物或其殺有害生物可接受性鹽作為活性成分。實例2A-2M中所述之組合物各可稀釋或適用於田地之濃度之可噴霧組合物。組合物實例2A-2M中所用之成分之一般化學描述(下列所有百分比均為重量百分比)如下：

<u>商品名</u>	<u>化學描述</u>
Ethylan BCP	壬基酚環氧乙烷縮合物
Soprophor BSU	三苯乙烯基酚環氧乙烷縮合物
Arylan CA	十二烷基苯磺酸鈣之70% w/v溶液
Solvesso 150	輕質C ₁₀ 芳族溶劑
Arylan S	十二烷基苯磺酸鈉
Darvan No2	木質磺酸鈉
Celite PF	合成矽酸鎂載體
Sopropon T36	聚羧酸之鈉鹽
Rhodigel 23	多醣漢生膠
Bentone 38	蒙脫土鎂之有機衍生物
Aerosil	微細二氧化矽

實例2A

以下列組成製備水溶性濃縮物：

活性成分	7%
Ethylan BCP	10%
N-甲基吡咯酮	83%

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (41)

於溶於部份 N- 甲基吡咯酮之 Ethylan BCP 溶液中，在加熱及攪拌下加入活性成分直至溶解。所得溶液以剩餘溶劑調至所需容積。

實例 2 B

以下列組成製備可乳化濃縮物 (EC)：

活性成分	25%(最大)
Soprophor BSU	10%
Arylan CA	5%
N-甲基吡咯酮	50%
Solvesso 150	10%

前三種成分溶於 N- 甲基吡咯酮中，接著於其中添加 Solvesso 150 而得最終容積。

實例 2 C

以下列組成製備可溼性粉末 (WP)：

活性成分	40%
Arylan S	2%
Darvan 2 號	5%
Celite PF	53%

混合各成分並於錘磨機中研磨得粒徑小於 50 微米之粉末。

實例 2 D

以下列組成製備水性可流動配方：

活性成分	40.0%
Ethylan BCP	1.00%

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

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 (42)

Sopropon T360	0.20%
乙 二 醇	5.00%
Rhodigel 230	0.15%
水	53.65%

緊密混合諸成分並於球磨機中研磨至得至平均粒徑小於3微米。

實例 2 E

以下列組成製備可乳化懸浮液濃縮物：

活性成分	30.0%
Ethylan BCP	10.0%
Bentone 38	0.5%
Solvesso 150	59.5%

緊密混合諸成分並於球磨機中研磨直至得到小於3微米之平均粒徑。

實例 2 F

以下列組成製備水可分散性顆粒：

活性成分	30%
Darvan No2	15%
Arylan S	8%
Celite PF	47%

於流化能研磨機中混合各成分並微米化，接著以水(達10%)噴霧於旋轉造粒機中造粒，所得顆粒於流體化床乾燥機中乾燥而移除過量水。

實例 2 G

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

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 (43)

以下列組成物製備撒佈粉：

活性成分	1 至 10 %
超細滑石粉	99 至 90 %

緊密混合各成分且若需要再研磨以得細粉末。此粉末施加至節肢動物感染區，例如廢棄垃圾、貯存產品或家用物品或受節肢動物感染或易受其感染之動物上，以防治藉口攝食之節肢動物。分佈該撒佈粉至節肢動物感染區之適宜方式包含機械吹風、手搖動機或家畜類自我處理設備。

實例 2 H

以下列組成製備可食性餌：

活性成分	0.1 至 1.0 %
小麥粉	80 %
Molasses	19.9 至 19 %

緊密混合各成分且如需要形成餌狀。此可食性餌分佈在例如家用或工業房屋內如廚房、醫院或商店，或戶外受節肢動物例如蟻、蚱蜢、蟑螂或蒼蠅感染之處，以防治以口攝食之節肢動物。

實例 2 I

以下列組成製備溶液配方：

活性成分	15 %
二甲基亞碲	85 %

活性成分溶於二甲基亞碲中並混合及若需要予以加熱。此溶液以傾倒施用方式經皮施用至受節肢動物感染之家庭動物上，或經聚氟乙烯膜(0.22微米孔徑)過濾消毒後，以

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (44)

每100公斤動物體重自1.2至12毫升溶液之施用率非經腸道注射。

實例 2 J

以下列組成製備可溼性粉末：

活性成分	50%
Ethylan BCP	5%
Aerosil	5%
Celite PF	40%

Ethylan BCP吸附至Aerosil上，接著與其他成分混合並於錘磨機中研磨而得可溼性粉末，其可以水稀釋至自0.001%至2%重量之活性化合物，並藉噴霧施用至受節肢動物如雙翅類幼蟲或植物線蟲感染之區域，或藉噴霧或浸漬或於飲水中以口服投藥至受節肢動物、寄生蟲或原生動物感染或有受其感染之危險之家庭動物上，以防治節肢動物、寄生蟲或原生動物。

實例 2 K

由含有視需要而定之可變百分比之下列成分(百分比類似於前述組合物者)之顆粒形成緩釋性球粒組合物：

- 活性成分
- 密實劑
- 緩釋劑
- 黏合劑

緊密混合之諸成分形成顆粒並壓縮成比重為2或更大之球粒。此可口服投與至反芻性家庭動物以留滯在網狀組織

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (45)

內而可在延長時間內持續緩慢釋出活性化合物以防治反芻性家庭動物受節肢動物、寄生蟲或原生動物感染。

實例 2 L

以下列組成製備呈顆粒狀、粒片狀、磚狀之緩釋性組合物：

活性成分	0.5至25%
聚氯乙烯	75至99.5%
酞酸二辛酯(塑化劑)	

摻合各成分並藉熔融擠出或模製形成適宜形狀。該等組合物可用以例如加至靜止水中或用以製成貼附至家庭動物上之項圈或耳環，以藉緩慢釋出而防治害蟲。

實例 2 M

以下列組成製備水可分散顆粒：

活性成分	85%(最大)
聚乙烯吡咯酮	5%
綠坡縷石黏土	6%
月桂基硫酸鈉	2%
甘油	2%

各成分與水混合成45%漿料並溼研磨成粒徑4微米，接著噴霧乾燥以移除水。

雖然本發明以各種較佳具體例加以說明，但熟悉本技藝者可了解在不違離本發明精神之下可作各種改質、替代、省略及改變。據此本發明之範圍僅受限於下列之申請專利範圍，包含其對等物。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

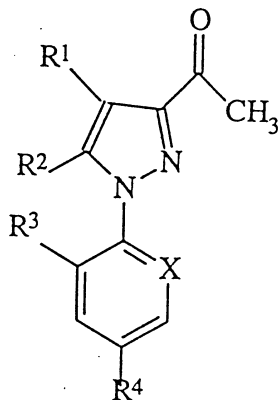
訂

線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

四、中文發明摘要 (發明之名稱： 殺有害生物性1-芳基吡唑)

本發明係有關式 (I) 之 1-苯基吡唑衍生物：

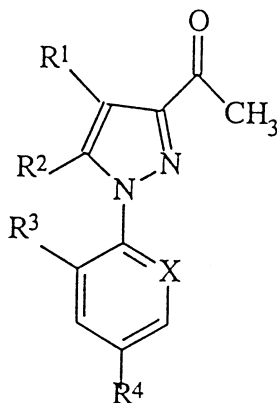


(I)

其中 R^1 , R^2 , R^3 , R^4 及 X 如說明書中之定義；及有關其作為殺昆蟲劑之用途。

英文發明摘要 (發明之名稱： "PESTICIDAL 1-ARYLPYRAZOLES")

The invention relates to 1-phenylpyrazole derivatives of formula (I):

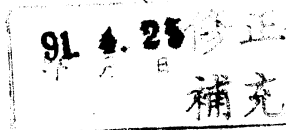


(I)

wherein R^1 , R^2 , R^3 , R^4 and X are as defined in the description, and to their use as insecticides.



六、申請專利範圍



1. 一種化合物，其係：

3-乙醯基-5-胺基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞磺醯基吡唑，

3-乙醯基-5-胺基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-乙基亞磺醯基吡唑，

3-乙醯基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-5-乙胺基-4-甲基亞磺醯基吡唑，

3-乙醯基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-5-甲胺基-4-甲基亞磺醯基吡唑，

3-乙醯基-5-(2-胺甲醯基甲胺基)-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞磺醯基吡唑，

3-乙醯基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-5-(2-乙磺醯基乙胺基)-4-甲基亞磺醯基吡唑，

3-乙醯基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-5-(2-胺甲醯基乙胺基)-4-甲基亞磺醯基吡唑，

3-乙醯基-5-胺基-1-(2-溴-6-氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞磺醯基吡唑，

3-乙醯基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞磺醯基-5-三氟甲基硫基胺基吡唑，或

3-乙醯基-5-胺基-1-(2,6-二氯-4-五氟硫基苯基)-4-甲基亞磺醯基吡唑，或

其殺蟲可接受之鹽。

2. 根據申請專利範圍第1項之化合物，其係3-乙醯基-5-胺基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞磺醯基吡唑或

六、申請專利範圍

其殺蟲可接受之鹽。

3. 一種殺蟲組合物，包括殺蟲有效量之根據申請專利範圍第1項之化合物或其殺蟲可接受之鹽，以及殺蟲可接受之稀釋劑或載劑。
4. 根據申請專利範圍第3項之殺蟲組合物，其中該有效量係殺蚜蟲之有效量。
5. 根據申請專利範圍第3項之殺蟲組合物，其含有約0.00005%至約90%(重量)之該化合物。
6. 根據申請專利範圍第3項之殺蟲組合物，包括殺蟲有效量之根據申請專利範圍第2項之化合物或其殺蟲可接受之鹽，以及殺蟲可接受之稀釋劑或載劑。
7. 根據申請專利範圍第6項之殺蟲組合物，其中該有效量係殺蚜蟲之有效量。
8. 根據申請專利範圍第6項之殺蟲組合物，其含有約0.00005%至約90%(重量)之該化合物。
9. 一種於存在有或預期存在有昆蟲之區域防治昆蟲之方法，該方法包含施用於該區域殺蟲有效量之化合物，該化合物係
 - 3-乙醯基-5-胺基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞磺醯基吡唑，
 - 3-乙醯基-5-胺基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-乙基亞磺醯基吡唑，
 - 3-乙醯基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-5-乙胺基-4-甲基亞磺醯基吡唑，

六、申請專利範圍

- 3-乙醯基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-5-甲胺基-4-甲基亞磺醯基吡唑，
- 3-乙醯基-5-(2-胺甲醯基甲胺基)-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞磺醯基吡唑，
- 3-乙醯基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-5-(2-乙磺醯基乙胺基)-4-甲基亞磺醯基吡唑，
- 3-乙醯基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-5-(2-胺甲醯基乙胺基)-4-甲基亞磺醯基吡唑，
- 3-乙醯基-5-胺基-1-(2-溴-6-氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞磺醯基吡唑，
- 3-乙醯基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞磺醯基-5-三氟甲基硫基胺基吡唑；或其殺蟲可接受之鹽；
- 該施用係在哺乳類曝露至該化合物之狀況下進行。
10. 根據申請專利範圍第9項之方法，其中該化合物係3-乙醯基-5-胺基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞磺醯基吡唑或其殺蟲可接受之鹽。
11. 根據申請專利範圍第9項之方法，其中該昆蟲係吸吮性昆蟲。
12. 根據申請專利範圍第10項之方法，其中該昆蟲係吸吮性昆蟲。
13. 根據申請專利範圍第11項之方法，其中該吸吮性昆蟲係蚜蟲、植物爬蟲或椿象蟲。
14. 根據申請專利範圍第12項之方法，其中該吸吮性昆蟲係蚜蟲、植物爬蟲或椿象蟲。

六、申請專利範圍

15. 根據申請專利範圍第9項之方法，其中該區域係用於或欲用於使作物生長之區域且該化合物之施用率為5克至1公斤/公頃。
16. 根據申請專利範圍第10項之方法，其中該區域係用於或欲用於使作物生長之區域且該化合物之施用率為5克至1公斤/公頃。
17. 根據申請專利範圍第9項之方法，其中該區域係指動物且該化合物之施用率為每天每公斤動物體重為0.1至20毫克。
18. 根據申請專利範圍第10項之方法，其中該區域係指動物且該化合物之施用率為每天每公斤動物體重為0.1至20毫克。
19. 一種製備根據申請專利範圍第1項之化合物之方法，該方法包括：
 - (a)使相關5-胺基-3-氰基-1-(2,4,6-三取代苯基)-4-甲基亞磺醯基吡唑或5-胺基-3-氰基-1-(2,4,6-三取代苯基)-4-乙基亞磺醯基吡唑與式 CH_3M 化合物(其中M為鹼金屬或鹼土金屬鹽)反應；
 - (b)使3-乙醯基-5-胺基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞磺醯基吡唑與三氟甲基硫氯硫化，以製得3-乙醯基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞磺醯基-5-三氟甲基硫基胺基吡唑；爾後，若需要，可將該化合物轉化為其殺蟲可接受之鹽。
20. 根據申請專利範圍第19項之方法，該方法包含使5-胺

六、申請專利範圍

基-3-氰基-1-(2,6-二氯-4-三氟甲基苯基)-4-甲基亞
磺醯基吡唑與溴化甲基鎂反應。

裝

訂

線