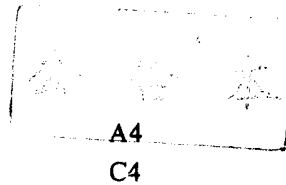


402485

申請日期	88.4.19
案 號	88106202
類 別	A01N53/00, C07C69/743

(以上各欄由本局填註)



402485

發 明 專 利 說 明 書

一、發明 名稱	中 文	除蟲菊酯化合物及含有該化合物作為活性成分之防治害蟲用組成物
	英 文	PYRETHROID COMPOUND AND COMPOSITION FOR CONTROLLING PEST CONTAINING THE SAME AS AN ACTIVE INGREDIENT
二、發明 創作人	姓 名	1. 大高健 2. 石渡多賀男
	國 籍	日本國
三、申請人	住、居所	1. 日本國大阪府豐中市曾根東町 2-11-8-507 2. 日本國大阪府豐中市曾根東町 2-11-8-403
	姓 名 (名稱)	住友化學工業股份有限公司
	國 籍	日本國
	住、居所 (事務所)	日本國大阪市中央區北濱四丁目 5 番 33 號
	代 表 人 姓 名	香西昭夫

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大 類：
I P C 分類：

A6

B6

本案已向：

日 本

國(地區) 申請專利, 申請日期: 案號: , ☒有 ☐無主張優先權
 1998 年 5 月 26 日 特 願 平 10-144080(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

五、發明說明(1)

本發明係有關一種除蟲菊酯化合物及含有該化合物作為活性成分之防治害蟲用之組成物。

[發明背景]

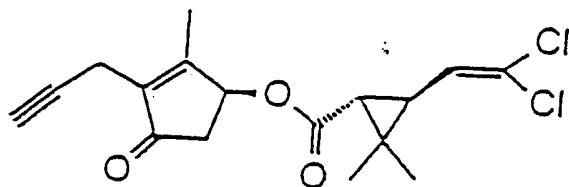
已知，例如鹵烯基環丙烷羧酸與 2-甲基-4-氧代基-3-(2-丙炔基)環戊-2-烯醇之酯具有殺蟲活性，見 GB-2055822-A。

然而，在施用含有上述酯類之彼等組成物時，依施用條件而定，通常不可避免的不只受限於其防治效果，亦受限於其安全性。尤其，一般用於預防傳染病用之防治害蟲用之組成物主要是在生活環境之有限空間中使用，因此彼等組成物需要具有所需之殺蟲活性或忌避活性，且需對哺乳類如人類、家畜及寵物明顯無害。

[發明大綱]

鑑於上述情形，本發明者致力研究，並發現 3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基環丙烷羧酸 2-甲基-4-氧代基-3-(2-丙炔基)-環戊-2-烯酯之特殊光學活性反式異構物為在害蟲防治上具優異效果且對哺乳類無害之化合物，因而完成本發明。

因此，本發明係有關一種下式所示之 (1R)-反式-3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基環丙烷羧酸 (S)-2-甲基-4-氧代基-3-(2-丙炔基)-環戊-2-烯酯(下文稱為本化合物)：



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

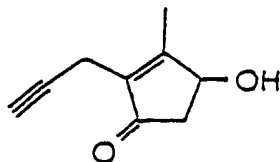
訂

線

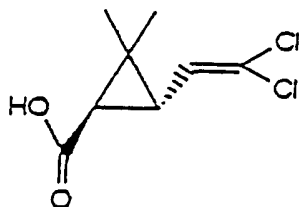
五、發明說明(2)

及含有本化合物作為活性成分之防治害蟲用組成物。

本發明化合物可藉由，例如，使下式所示之(S)-2-甲基-4-氧代基-3-(2-丙炔基)-環戊-2-烯基醇(下文稱為醇化合物)：



與下式所示之(1R)-反式-3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基環丙烷羧酸(下文稱為羧酸化合物)：



或該羧酸化合物之反應性衍生物(例如醯鹵或酸酐)反應而製得。

該反應通常在縮合劑或鹼存在下之溶劑中進行。

縮合劑包含例如二環己基羰二亞胺(DCC)及1-乙基-3-(3-二甲胺基丙基)羰二亞胺鹽酸鹽(WSC)。

鹼包含例如有機鹼，如三乙基胺、吡啶、N,N-二乙基苯胺、4-二甲胺基吡啶及二異丙基乙基胺。

溶劑包含例如烴類，如苯、甲苯及己烷；醚類，如乙醚及四氫呋喃等；及鹵化烴類，如二氯甲烷及1,2-二氯乙烷。

反應時間通常在5分鐘至72小時間之範圍內。

反應溫度通常在-20℃至+100℃間之範圍內(或當反應中所用溶劑之沸點低於+100℃時，自-20℃至反應所用溶

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(3)

劑之沸點)，較佳自 -5°C 至 $+100^{\circ}\text{C}$ (或當反應中所用溶劑之沸點低於 $+100^{\circ}\text{C}$ 時，自 -5°C 至反應所用溶劑之沸點) 之間之範圍內。

雖然羧酸化合物或其反應性衍生物對醇化合物之莫耳比可任意選擇而無任何限定，但較佳二者係以約 1:1 之莫耳比進行反應。

縮合劑或鹼對醇化合物可使用任意比例，但較好每莫耳醇化合物使用 1 莫耳至 5 莫耳。

本化合物於反應完成後，可藉由使反應溶液進行一般之後處理，如以有機溶劑萃取及濃縮等製得。若需要，可藉由習知之操作，如層析、蒸餾及再結晶進一步純化。

該醇化合物可依據例如美國專利第 4,571,436 號案等揭示之方法製備。該羧酸化合物可依據例如 JP-A-4-234991 等揭示之方法製備。

本化合物能展現其防治效果之害蟲實例為下述節肢動物。由於本化合物可使用作為防治下述節肢動物用之組成物之活性成分，且其於安全因素上特別優越，因此特別有效作為對哺乳類所需具高度安全性之預防傳染病用之防治害蟲用之組成物。

鱗翅目：

螟蛾科 (Pyralidae)，如二化螟 (Chilo suppressalis) (稻水螟)、稻縱捲螟 (Cnaphalocrocis medinalis) (稻捲葉蟲) 及印度谷螟 (Plodia interpunctella) (印度谷螟)；夜蛾科 (Noctuidae)，如斜紋夜蛾 (Spodoptera litura) (煙草地老

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(4)

虎)、東方黏蟲 (Pseudaletia separata)(稻黏蟲)及甘藍夜蛾 (Mamestra brassicae)(甘藍黏蟲); 粉蝶科 (Pieridae), 如甘藍菜粉蝶 (Pieris rapae crucivora)(普通甘藍蟲); 捲葉蛾科 (Tortricidae), 如小捲葉蛾 (Adoxophyes spp.); 果蛀蛾科 (Carposinidae); 潛蛾科 (Lyonetiidae); 毒蛾科 (Lymantriidae); Antographa 屬; 地老虎屬 (Agrotis spp.), 如黃地老虎 (Agrotis segetum)(蕪菁地老虎)及小地老虎 (Agrothis ipsilon)(黑地老虎); 烟夜蛾屬 (Helicoverpa spp.); 夜蛾屬 (Heliothis spp.); 小菜蛾 (Plutella xylostella); 直紋稻苞蟲 (Parnara guttata)(直紋稻苞蟲); 網衣蛾 (Tinea translucens)(網衣蛾); 袋衣蛾 (Tineola bisselliella)(袋衣蛾)等。

雙翅目:

庫蚊屬 (Culex spp.), 如赤家蚊 (Culex pipiens pallens)(普通家蚊)及三帶庫蚊 (Culex tritaeniorhynchus); 伊蚊屬 (Aedes spp.), 如埃及伊蚊 (Aedes aegypti)及伊蚊 (Aedes albopictus); 按蚊屬 (Anopheles spp.), 如按蚊 (Anopheles sinensis); 搖蚊科 (Chironomidae; 蚊蚋); 家蠅科 (Muscidae), 如家蠅 (Muscina domestica)、廐腐蠅 (Muscina stabulans)(廐腐蠅)及黃腹廐腐蠅 (Fannia canicularis)(小家蠅); 麗蠅科 (Calliphoridae); 麻蠅科 (Sarcophagidae); 花蠅科 (Anthomyiidae), 如種蠅 (Delia platura)(種蠅)及蔥蠅 (Delia antiqua); 實蠅科 (Tephritidae)(果蠅); 果蠅科 (Drosophilidae)(小果蠅, 醋蠅); 毛蠅科 (Psychodidae;

(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)

蛾蠅、砂蠅)；墨蚊科(Simuliidae；黑蚊)；虻科(Tabanidae)；螫蠅科(Stomoxysidae)；蠓(biting midges)等。

網翅目：

德國小蠊(Blattella germanica)(德國蟑螂)；烟色大蠊(Periplaneta fuliginosa)(烟色蟑螂)；美洲大蠊(Periplaneta americana)(美洲蟑螂)；褐色大蠊(Periplaneta brunnea)(褐色蟑螂)；東方非蠊(Blatta orientalis)(東方蟑螂)等。

膜翅目：

蟻科(Formicidae；蟻)；胡蜂科(Vespidae；大胡蜂)；腫腿蜂科(Bethylidae)；葉蜂科(Tenthredinidae；葉蜂)，如黃翅菜葉蜂(Athalia rosae ruficornis)(菜葉蜂)等。

蚤目：

狗櫛頭蚤(Ctenocephalides canis)、貓櫛頭蚤(Ctenocephalides felis)、人蚤(Pulex irritans)等。

虱目：

體虱(Pediculus humanus)、陰虱(Phthirus pubis)等。

等翅目：

白蟻(Reticulitermes speratus)、台灣家白蟻(Coptotermes formosanus)(台灣家白蟻)等。

蟎蟬目：

刺皮蟎科(Pyroglyphidae)，如美洲家刺皮蟎(Dermatophagoides farinae)及歐洲家刺皮蟎(Dermatophagoides pteronyssinus)；粉蟎科(Acaridae)，如：腐食酪蟎(Tyrophagus putrescentiae Schrank)(腐食酪

(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)

蟎)及橢圓嗜粉蟎(Aleuroglyphus ovatus Troupeau); 食甜蟎科(Glycyphagidae), 如: 隱秘食甜蟎(Glycyphagus privatus)、家食甜蟎(Glycyphagus domesticus)及害嗜鱗蟎(Glycyphagus destructor Schrank); 肉食蟎科(Cheyletidae), 如: 麻六甲肉食蟎(Cheyletus malaccensis)及 Cheyletus moorei; 附線蟎科(Tarsonemidae); 嗜草蟎(Chrtoglyphus); 甲蟎總股(Oribatei); 葉蟎科(Tetranychidae)(蛛蟎), 如朱砂葉蟎(Tetranychus urticae)(兩點紅蜘蛛); 神澤葉蟎(Tetranychus kanzawai)(神澤蛛蟎); 柑桔全爪蟎(Panonychus citri)(柑桔紅蟎); 蘋果全爪蟎(Panonychus ulmi)(歐洲紅蟎)等; 蜱科(Ixodidae), 如長角血蜱(Haemaphysalis longiconis); 等。

半翅目:

飛虱科(Delphacidae; 飛虱), 如稻灰飛虱(Laodelphax striatellus)(小褐飛虱)、稻褐飛虱(Nilaparvata lugens)(褐飛虱)及白背飛虱(Sogatella furcifera)(白背稻飛虱); 葉蟬科(Deltocephalidae)(葉蟬), 如黑尾葉蟬(Nephotettix cincticeps)及微綠葉蟬(Nephotettix virescens); 蚜科(Aphididae)(蚜蟲); 椿科(Pentatomidae); 粉虱科(Aleyrodidae; 粉虱); 蚧科(Coccidae; 介殼蟲); 網椿科(Tingidae; 網椿); 木虱科(Psyllidae)等。

鞘翅目:

單色皮蠹(Attagenus unicolor); 紅斑皮蠹(Anthrenus verbasci); 玉米根蟲, 如玉米根葉甲(Diabrotica virgifera)

(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)

(西方玉米根蟲)及十一星瓜葉甲(Diabrotica undecimpunctata howardi)(南方玉米根蟲);金龜甲科(Scarabaeidae)如大綠麗金龜(Anomala cuprea)及大豆姬金龜(Anomala rufocuprea)(大豆甲蟲);象甲總科(Curculionidae),如玉米象(Sitophilus zeamais)、稻象甲(Lissorhoptrus oryzophilus)、球象甲(Anthonomus grandis grandis)及綠豆象(Callosobruchus chinensis);擬步甲蟲科(Tenebrionidae;擬步甲),如黃粉甲(Tenebrio molitor)(黃粉蟲)及赤擬谷盜(Tribolium castaneum)(赤擬谷盜);葉甲科(Chrysomelidae;玉米根蟲),如稻負泥蟲(Oulema oryzae)、黃條跳甲(Phyllotreta striolata)及黃守瓜(Aulacophora femoralis)(守瓜);竊蠹科(Anobiidae);瓢蟲屬(*Epilachna* spp.),如二十八星瓢蟲(Epilachna vigintioctopunctata);粉蠹科(Lyctidae;竹蠹);長蠹科(Bostrychidae;偽竹蠹);天牛科(Cerambycidae);袍甲蟲(Paederus fuscipes)等。

纓翅目:

棕櫚薊馬(Thrips palmi)、花薊馬(Thrips hawaiiensis)等。

直翅目:

螻蛄科(*Gryllotalpidae*;螻蛄);蝗科(*Acrididae* 蝗蟲)等。

本發明中,該用以防治害蟲用之組成物,係用以防治節肢動物如昆蟲及/或蠕蟬。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明(8)

當使用本化合物作為防治害蟲用組成物之活性成分時，其通常是在藉由使本化合物或其溶液與固體載劑、液體載劑、氣體載劑、毒餌用之基質材料或蚊香捲用之基質材料混合，並視需要添加調配用佐劑如界面活性劑，或以本化合物或其溶液浸漬基質材料如蚊香捲或蚊香片，而調配成各種調配劑後施用，彼等調配劑例如油調配劑；可乳化濃縮劑；可濕性粉劑；可流動性濃縮劑(例如水性懸浮液濃縮劑及水性乳液濃縮劑)；顆粒；細粉劑；噴霧劑；加熱燻蒸劑，如：蚊香捲、電蚊香片及使用吸收芯之加熱燻蒸劑用之液體；加熱煙燻調配劑，如自燃型煙燻調配劑、化學反應型煙燻調配劑及使用多孔陶瓷片之電加熱型煙燻調配劑；非加熱揮發型調配劑，如樹脂之揮發型調配劑及經浸漬紙之非加熱揮發型調配劑；生霧劑；ULV調配劑；毒餌等。

此等調配劑通常含有含量為 0.001 至 95 重量%之本化合物作為活性成份。

供調配劑使用之固體載劑包含例如無機載劑之細粉及顆粒，如黏土[如，高嶺黏土、矽藻土、合成水合二氧化矽、皂土、富巴沙米黏土(Fubasami clay)及酸性黏土]、滑石、陶瓷、絹雲母、石英及碳酸鈣；合成樹脂如聚乙烯及聚丙烯；及自植物獲得之載劑，如木粉及活性碳。液體載劑包含例如水、醇(如：甲醇、乙醇及高級醇類)、酮類(如：丙酮及甲基乙基酮)、芳族烴類(如：苯、甲苯、二甲苯、乙基苯及甲基萘)、脂族烴(如：己烷、環己烷、煤

(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)

油及輕油)、酯類(如乙酸乙酯及乙酸丁酯)、腈類(如：乙腈及異丁腈)、醚類(如：異丙醚及二噁烷)、醯胺類(如：N,N-二甲基甲醯胺及 N,N-二甲基乙醯胺)、鹵化烴類(如二氯甲烷、三氯乙烷及四氯化碳)、二甲亞砷及植物油(如：大豆油及棉籽油)。液化氣體載劑包含例如氟碳化物、氟烴、LPG(液化石油氣)、二甲醚、及二氧化碳。

界面活性劑包含例如烷基硫酸酯、烷基磺酸酯、烷基芳基磺酸酯、烷基芳基醚及其聚氧乙烯化之產物、聚乙二醇醚、多元醇酯及糖醇衍生物。

調配用佐劑如黏著劑及分散劑包含例如酪蛋白、明膠、多糖類(如：澱粉、阿拉伯膠、纖維素衍生物及藻朊酸)、木質素衍生物、皂土、糖、及合成水溶性聚合物[如，聚(乙烯醇)類、聚(乙烯吡咯烷酮)類及聚(丙烯酸)類]。安定劑之實例包含 PAP(酸性磷酸異丙酯)、BHT (2,6-二-第三丁基-4-甲基酚)、BHA(2-第三丁基-4-甲氧基酚與 3-第三丁基-4-甲氧基酚之混合物)、植物油、礦物油、界面活性劑及脂肪酸或脂肪酸酯。

蚊香捲用之基質材料包含例如植物性粉末(例如木粉及除蟲菊渣)與黏結劑(如太白粉、澱粉及麵筋)之混合物。

電蚊香片用之基質材料包含例如由棉線集結之纖維或由棉線及紙漿所成之混合物獲得之片材。

自燃型煙燻調配劑用之基質材料包含例如可燃劑及生熱劑(如，硝酸鹽、亞硝酸鹽、胍鹽、氯化鉀、硝基纖維素、乙基纖維素及木粉)、熱裂化促進劑(如，鹼金屬鹽類、

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (10)

鹼土金屬鹽類、重鉻酸鹽及鉻酸鹽)、氧氣供應劑(如，硝酸鉀)、助燃劑(蜜胺及小麥澱粉)、增補劑(如，矽藻土)及黏結劑(如，合成糊料)。

化學反應型煙燻調配劑用之基質材料包含例如生熱劑(如，硫化物、多硫化物、硫氫化物及鹼金屬水合鹽，以及氧化鈣)、觸媒(如，含碳物質、碳化鐵及活性黏土)、有機發泡劑(如，偶氮二甲醯胺、苯磺醯基肼、二亞硝基五亞甲基四胺、聚苯乙烯及聚尿烷)及填充劑(如，天然纖維片及合成纖維片)。

非加熱揮發型調配劑用之基質材料包含例如熱塑性樹脂、濾紙及日本紙。

毒餌之基質材料包含例如誘餌成分(如：穀粉、植物油、糖及結晶性纖維素)、抗氧化劑(如：二丁基羥基甲苯及降二氫愈瘡木酸)、保存劑(如：脫氫乙酸)、防止小孩或寵物誤食劑(如：紅辣椒粉)、吸引劑(如：乳酪香味、洋蔥香味及花生油)。

可流動性濃縮劑(水性懸浮液濃縮劑或水性乳液濃縮劑)通常包括本化合物、分散劑、懸浮助劑(例如，能賦予搖觸變之保護性膠體或化合物)、適當之佐劑(如：消泡劑、防銹劑、安定劑、展著劑、穿透助劑、抗凍劑、殺細菌劑及殺真菌劑)及水。該保護性膠體包含例如明膠、酪蛋白、膠、纖維素醚及聚(乙烯醇)類。該能賦予觸變性之化合物包含例如皂土、矽酸鋁鎂、黃原膠及聚(丙醯酸)類。亦可藉由實質上無法溶解本化合物之油代替水，以製備油性分

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (11)

散液。

如此獲得之調配劑可就其所製備者或以水等稀釋而使用，依目的而定。

該調配劑亦與其它殺昆蟲劑、殺蟎劑、忌避劑、增效劑等或其組合混合使用。

殺昆蟲劑及殺蟎蟲劑之實例包含有機磷化合物，例如，撲滅松(Fenitrothion)[O-(3-甲基-4-硝苯基)硫代磷酸 O,O-二甲酯]，芬殺松(Fenthion)[O-(3-甲基-4-(甲硫基)苯基)硫代磷酸 O,O-二甲酯]，大利農(Diazinon)[O-2-異丙基-6-甲基嘧啶-4-基硫代磷酸 O,O-二乙酯]，陶斯松(Chlorpyrifos)[O-3,5,6-三氯-2-吡啶基硫代磷酸 O,O-二乙酯]，好勝(Acephate)[O,S-二甲基乙醯基硫代磷醯胺]，滅大松(Methidathion)[O,O-二甲基二硫代磷酸 S-2,3-二氫-5-甲氧基-2-氧代-1,3,4-噻二唑-3-基甲酯]，二硫松(Disulfoton)[S-2-乙硫乙基二硫代磷酸 O,O-二乙酯]，二氯松(DDVP)[磷酸 2,2-二氯乙基二甲酯]，硫普松(Sulprofos)[S-丙基二硫代磷酸 O-乙酯 O-4-(甲硫基)苯酯]，氰乃松(Cyanophos)[O,O-二甲基硫代磷酸 O-4-氰苯酯]，大克苯松(Dioxabenzofos)[2-甲氧基-4H-1,3,2-苯并二噁磷雜芑(phosphorin)-2-硫化物]，大滅松(Dimethoate)[二硫代磷酸 O,O-二甲酯 S-(N-甲基胺甲醯甲酯)]，稻豐散(Phenthoate)[2-二甲氧磷硫醯基硫(苯基)乙酸乙酯]，馬拉松(Malathion)[(二甲氧磷硫醯基硫(苯基)丁二酸二乙酯)]，三氯仿(Trichlorfon)[2,2,2-三氯-1-羥乙基膦酸二甲酯]，

五、發明說明 (12)

谷速松 (Azinphos-methyl) [O,O-二甲基二硫代磷酸 S-3,4-二氫-4-氧代-1,2,3-苯并三吡-3-基甲酯]，亞素靈 (Monocrotophos) [磷酸二甲酯 (E)-1-甲基-2-(甲胺甲醯基) 乙烯酯]，及愛殺松 (Ethion) [O,O,O',O'-四乙基 S,S'-伸甲基雙(二硫代磷酸酯)]；胺基甲酸酯化合物，例如，丁基滅必蝨 (BPMC) [甲基胺基甲酸 2-第二丁基苯酯]，免扶克 (Benfracarb) {N-[2,3-二氫-2,2-二甲基苯并呋喃-7-基氧羰基(甲基)胺硫基]-N-異丙基-β-丙胺酸乙酯}，安丹 (Propoxur) [N-甲基胺基甲酸 2-異丙氧苯酯]，加保芳 (Carbosulfan) [N-二丁胺硫基-N-甲基胺基甲酸 2,3-二氫-2,2-二甲基-7-苯并[b]呋喃基酯]，加保利 (Carbaryl) [N-甲基胺基甲酸 1-苯酯]，納乃得 (Methomyl) [S-甲基-N-[(甲基胺甲醯基)氧基]硫乙醯亞胺酯]，殺蟲丹 (Ethiofencarb) [2-(乙硫甲基)苯基甲基胺基甲酸酯]，得滅克 (Aldicarb) [2-甲基-2-(甲硫基)丙醛 O-甲基胺甲醯基肟]，歐殺滅 (Oxamyl) [N,N-二甲基-2-甲胺甲醯氧亞胺基-2-(甲硫基)乙醯胺]，及芬硫克 (Phenothiocarb) [S-(4-苯氧丁基)-N,N-二甲硫基胺甲酸酯]；擬除蟲菊酯 (pyrethroid) 化合物，例如，乙芬普 (Etofenprox) [2-(4-乙氧苯基)-2-甲基丙基-3-苯氧苯甲基醚]，芬伯雷 (Fenvalerate) [(RS)-2-(4-氯苯基)-3-甲基丁酸 (RS)-α-氰基-3-苯氧苯甲酯]，易芬伯雷 (Esfenvalerate) [(S)-2-(4-氯苯基)-3-甲基丁酸 (S)-α-氰基-3-苯氧基苯甲酯]，芬普寧 (Fenpropathrin) [2,2,3,3-四甲基環丙烷羧酸 (RS)-α-氰基-3-苯氧苯甲酯]，賽滅寧 (Cypermethrin)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (13)

[(1RS)-順式，反式-3-(2,2-二氯乙基)-2,2-二甲基環丙烷羧酸(RS)- α -氰基-3-苯氧基苯甲酯]，百滅寧(Permethrin)

[(1RS)-順式，反式-3-(2,2-二氯乙基)-2,2-二甲基環丙烷羧酸 3-苯氧基苯甲酯]，賽洛寧(Cyhalothrin) [(Z)-(1RS)-順式-3-(2-氯-3,3,3-三氟丙-1-烯基)-2,2-二甲基環丙烷羧酸(RS)- α -氰基-3-苯氧基苯甲酯]，第滅寧(Deltamethrin)

[(1R)-順式-3-(2,2-二溴乙基)-2,2-二甲基環丙烷羧酸(S)- α -氰基-3-苯氧基苯甲酯]，環普寧(Cycloprothrin)

[(RS)-2,2-二氯-1-(4-乙氧苯基)環丙烷羧酸(RS)- α -氰基-3-苯氧基苯甲酯]，福化利(Fluvalinate) (N-(2-氯- α,α,α -三氟-對-甲苯基)-D-纈胺酸 α -氰基-3-苯氧基苯甲酯)，畢芬寧(Bifenthrin) [(Z)-(1RS)-順式-3-(2-氯-3,3,3-三氟-1-丙烯基)-2,2-二甲基環丙烷羧酸(2-甲基聯苯-3-基中)酯]，2-甲基-2-(4-溴二氟甲氧基苯基)丙基(3-苯氧基苯甲基醚)，催滅寧(Tralomethrin) [(1R-順式)3-{(1RS)(1,2,2,2-四溴乙基)}-2,2-二甲基環丙烷羧酸(S)- α -氰基-3-苯氧基苯甲酯]，矽氟芬(Silafluofen) [4-乙氧苯基{3-(4-氟-3-苯氧基苯基)丙基}二甲基矽烷]，d-費若寧(d-Fenothrin) [(1R-順式，反式)菊酸 3-苯氧基苯甲酯]，賽芬寧(d-Cyphenothrin) [(1R-順式，反式)菊酸(RS)- α -氰基-3-苯氧基苯甲酯]，d-利滅寧(d-Resmethrin) [(1R-順式，反式)菊酸 5-苯甲基-3-呋喃基甲酯]，克納寧(acrinathrin) [(S)- α -氰基-3-苯氧基苯甲基(1R-順式-2,2-二甲基-3-{3-氧代-3-(1,1,1,3,3,3-六氟丙氧基)丙烯基}環丙烷羧酸酯]，賽扶寧(Cyfluthrin) [3-(2,2-二氯乙

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (14)

烯基)-2,2-二甲基環丙烷羧酸(RS)- α -氰基-4-氟-3-苯氧苯甲酯], 特氟寧(Tefluthrin)[(1RS-順式(Z))-3-(2-氯-3,3,3-三氟丙-1-烯基)-2,2-二甲基環丙烷羧酸 2,3,5,6-四氟-4-甲基苯甲酯], 反氟寧(Transfluthrin)[(1R-反式)-3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基環丙烷羧酸 2,3,5,6-四氟苯甲酯], 治滅寧(Tetramethrin)[(1RS)-順式, 反式-菊酸 3,4,5,6-四氫酞醯亞胺甲酯], 亞烈寧(Allethrin)[(1RS)-順式, 反式-菊酸(RS)-3-烯丙基-2-甲基-4-氧代-環戊-2-烯酯], 巴利寧(Prallethrin)[(1R)-順式, 反式-菊酸(S)-2-甲基-4-氧代-3-(2-丙炔基)-環戊-2-烯酯], 艾潘寧(Empenthrin)[(1R)-順式, 反式-菊酸(RS)-1-乙炔基-2-甲基-2-戊烯酯], 米普寧(Imiprothrin)[(1R)-順式, 反式-2,2-二甲基-3-(2-甲基丙-1-烯基)環丙烷羧酸 2,5-二氧代-3-(丙-2-炔基)咪唑啉-1-基甲酯], d-弗米寧(d-Flamethrin)[(1R)-順式, 反式-菊酸 5-(2-丙炔基)糠酯], 及 2,2,3,3-四甲基環丙烷羧酸 5-(2-丙炔基)糠酯; N-氰脒衍生物, 例如, N-氰基-N'-甲基-N'-(6-氯-3-吡啶甲基)乙脒, 氯化烴化合物, 例如, 安殺番(Endosulfan)[6,7,8,9,10,10-六氯-1,5,5a,6,9,9a-六氫-6,9-甲橋-2,4,3-苯并二噁噻吡(benzodioxathiepine)氧化物], 蟲必死(γ -BHC)[1,2,3,4,5,6-六氯環己烷]及大克蟎(Dicofol)[1,1-雙(4-氯苯基)-2,2,2-三氯乙醇]; 苯甲醯苯脒型化合物, 例如, 克福隆(Chlorfluazuron)[1-(3,5-二氯-4-(3-氯-5-三氟甲基吡啶-2-基氧基)苯基)-3-(2,6-二氟苯甲醯基)脒], 得福隆(Teflubenzuron)[1-(3,5-二氯-2,4-二氟苯基)-3-(2,6-二氟

(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)

苯甲醯基)脲]及氟芬隆(Flufenoxuron)[1-(4-(2-氯-4-三氯甲基苯氧基)-2-氟苯基)-3-(2,6-二氟苯甲醯基)脲]，硫脲衍生物，例如，二芬隆(Diaphenthiuron)[N-(2,6-二異丙基-4-苯氧苯基)-N'-第三丁基羰二亞胺]，苯基吡啶化合物，甲迪隆(Metoxadiazon)[5-甲氧基-3-(2-甲氧苯基)-1,3,4-噁二唑-2-(3H)-酮]，新殺蟎(Bromopropylat)[4,4'-二溴苯甲酸異丙酯]，得脫蟎(Tetradifon)[4-氯苯基 2,4,5-三氯苯基砒]，蟎離丹(Quinomethionate)[S,S-6-甲基喹啉-2,3-二基二硫碳酸酯]，塔免(Pyridaben)[2-第三丁基-5-(4-第三丁基苯甲基硫基)-4-氯吡啶-3(2H)-酮]，芬必滅(Fenpyroximate)[(E)-4-[(1,3-二甲基-5-苯氧吡啶-4-基)伸甲胺氧甲基]苯甲酸第三丁酯]，特芬得(Tebufenpyrad)[N-(4-第三丁基苯甲基)-4-氯-3-乙基-1-甲基-5-吡啶甲醯胺]，多萘菌素(polynactins)複合物[四萘菌素，二萘菌素及三萘菌素]，嘧啶芬(Pyrimidifen)[5-氯-N-[2-{4-(2-乙氧乙基)-2,3-二甲基苯氧基}乙基]-6-乙基嘧啶-4-胺]，米滅丁(Milbemectin)，亞滅丁(Abamectin)，伊滅丁(Ivermectin)，及印苦楝子素(Azadiractin)[AZAD]。

忌避劑之實例包含 3,4-長松針烷二醇、N,N-二乙基-間-甲苯醯胺、2-(2-羥乙基)-1-六氫吡啶羧酸 1-甲基丙酯、對-薄荷烷-3,8-二醇及植物精油，如薺菜油(hyssop oil)等。

增效劑之實例包含貳(2,3,3,3-四氯丙基)醚(S-421)、N(2-乙基己基)雙環[2.2.1]庚-5-烯-2,3-二羰亞胺(MGK-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · 訂 · 線

五、發明說明 (16)

264)、及 α -[2-(2-丁氧乙氧基)乙氧基]-4,5-亞甲二氧基-2-丙基甲苯(胡椒基丁氧化物)。

當將本化合物用作預防居家傳染病之防治害蟲用或防治動物害蟲用之組成物活性成分時，調配劑通常呈可乳化濃縮劑、可濕性粉劑、或可流動性濃縮劑的劑型，於以水稀釋後施用，施用濃度通常為 0.1 至 10,000 ppm。當調配劑呈油性調配劑、噴霧劑、燻蒸劑、煙燻調配劑、揮發性調配劑、成霧劑、ULV 調配劑、毒餌或樹脂調配劑時，可就所製備者予以使用。

上述調配劑之施用量與施用濃度可根據調配劑類型；調配劑施用之時間、地點、及方法、害蟲種類與損害程度等而適當決定。

實例

茲將參考下述製造例、調配例、及生物試驗例進一步詳細敘述本發明，但彼等實例並非用於限制本發明範疇。

首先說明本化合物之製造例。

製造例

於冰冷卻下，將 3.4g 吡啶添加至含 5.0g(S)-2-甲基-4-氧代基-3-(2-丙炔基)-環戊-2-烯基醇、8.0 g(1R)-反式-3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基-環丙烷羧酸氯化物及 50ml 甲苯之混合物中。所以得混合物於室溫攪拌 12 小時。其後將 50 ml 氯化銨飽和水溶液加至所得反應溶液中，及以每次 50ml 之乙醚萃取三次。以飽和氯化鈉水溶液洗滌所

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明 (17)

混合之乙醚層，以無水硫酸鈉脫水，及於減壓下濃縮。得殘留物進行矽膠管柱層析，接著自己烷及乙酸乙酯之混合溶劑再結晶，獲得 8.9 g(產率 78%)(1R)-反式-3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基環丙烷羧酸(S)-2-甲基-4-氧代基-3-(2-丙炔基)-環戊-2-烯酯(本化合物)。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \text{TMS 內部標準}) \delta(\text{ppm}): 1.21(\text{s}, 3\text{H}), 1.29(\text{s}, 3\text{H}), 1.64(\text{d}, 1\text{H}), 2.00(\text{t}, 1\text{H}), 2.18(\text{bs}, 3\text{H}), 2.2-2.3(\text{m}, 2\text{H}), 2.92(\text{dd}, 1\text{H}), 3.16(\text{d}, 2\text{H}), 5.64(\text{d}, 1\text{H}), 5.71(\text{bd}, 1\text{H})$ 。

如上文獲得之本化合物為實質上不具(1R)-順式異構物，且係應用於下述試驗例者。

接著，於下文說明調配例。於調配例中"份"皆為重量計。

調配例 1

取 20 份之本化合物，溶解於 65 份二甲苯中，再添加 15 份乳化劑 Sorpol 3005X(註冊商標，東邦化學股份有限公司)，充分攪拌並混合，獲得 20%可乳化濃縮劑。

調配例 2

使 40 份之本化合物與 5 份 Sorpol 3005X(如上述)充分混合，添加 32 份 Carplex #80(註冊商標，塩野義股份有限公司；合成水合二氧化矽之細粉)及 23 份 300 網目之矽藻土至其中，在果汁機中攪拌及混合所得之混合物，獲得 40%可濕性粉末。

調配例 3

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線

五、發明說明(18)

使 1.5 份之本化合物與 98.5 份 AGSOTBLVM-MS 24/48(微晶高嶺石之燒結產物，OIL DRI 公司製造；具 24 至 48 網目粒徑之顆粒載劑)充分混合，製成 1.5%顆粒。

調配例 4

將含有 10 份本化合物、10 份苯基二甲苯基乙烷、及 0.5 份 Sumidur L-75(住友拜耳尿烷股份有限公司所製造之二異氰酸二甲苯基酯)之混合物添加至 20 份 10%阿拉伯膠水溶液中。所得混合物以均混器攪拌，獲得具有平均粒徑為 $20\mu\text{m}$ 之乳液。接著將 2 份乙二醇加至該乳液中。使所得混合物於 60°C 熱水浴中反應 24 小時，獲得微膠囊漿液。另一方面，將 0.2 份黃原膠與 1.0 份 Veegum R(三洋化學工業股份有限公司所製造之矽酸鋁鎂)分散於 56.3 份離子交換水中，製得增稠劑溶液。

將 42.5 份上文製得之微膠囊漿液與 57.5 份上文製得之增稠劑溶液混合，獲得 10%微膠囊調配劑。

調配例 5

將含有 10 份本化合物與 10 份苯基二甲苯基乙烷之混合物加至 20 份 10%聚(乙二醇)之水溶液中。所得混合物於均混器中攪拌，獲得具有平均粒徑為 $3\mu\text{m}$ 之乳液。另一方面，將 0.2 份黃原膠與 1.0 份 Veegum R(三洋化學工業股份有限公司所製造之矽酸鋁鎂)分散於 58.8 份離子交換水中，製得增稠劑溶液。

將 40 份上文製得之乳液與 60 份上文製得之增稠劑溶液混合，獲得 10%可流動性調配劑。

(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)

調配例 6

使 5 份本化合物、3 份 Carplex #80(註冊商標，塩野義股份有限公司；合成水合二氧化矽之細粉)、0.3 份 PAP 及 91.7 份 300 網目之滑石在果汁機中攪拌及混合，製得 5% 細粉劑。

調配例 7

將 0.1 份本化合物溶解於 10 份二氯甲烷中，所得溶液再與 89.9 份 M(異鏈烷烴，由 Exxon 化學公司製造)混合，而獲得 0.1% 油性調配劑。

調配例 8

藉由使 1 份本化合物、5 份二氯甲烷與 34 份除味煤油混合製得溶液，將該溶液饋入噴霧劑容器中，然後在容器裝設閥元件，接著將 60 份推進劑(液化石油氣)經由閥元件壓入噴霧劑容器中，製得油性噴霧劑。

調配例 9

藉由使 0.6 份本化合物、5 份二甲苯、3.4 份除味煤油與 1 份乳化劑(Atmos 300；Atlas 化學公司之註冊商標)混合製得溶液，將該溶液與 50 份純水饋入噴霧劑容器中，然後在容器裝設閥元件，接著將 60 份推進劑(液化石油氣)經由閥元件壓入噴霧劑容器中，製得水性噴霧劑。

調配例 10

將 0.1g 本化合物溶解於 20ml 丙酮，使所得溶液與 99.9g 蚊香捲用之載劑(比例為 4:3:3 之太白粉、除蟲菊渣及木粉之混合物)均勻攪拌及混合，加 120ml 水至其中，

五、發明說明(20)

將混合物充分捏合，模塑，及乾燥該捏合之混合物，獲得蚊香捲。

調配例 11

將 0.2 g 本化合物及 0.4 g 胡椒基丁氧化物溶解於丙酮，製得總體積 10 ml 溶液。以 0.5 ml 上文所得之溶液均勻浸漬電蚊香片用之基質材料(使棉線與紙漿之混合物之纖維凝集製得之片材；面積 $2.5\text{ cm} \times 1.5\text{ cm}$ ，厚度 0.3 cm)，而獲得電蚊香片。

調配例 12

將 3 份本化合物溶解於 97 份除味煤油中，製得溶液。將所得之溶液裝入氯化乙烯製之容器中。在容器內插入吸收芯(以黏合劑使無機粉末凝結後，焙燒所得凝結粉末而製得者)之一端，使該吸收芯之另一端可經加熱器加熱，而獲吸收芯型加熱揮發裝置用之元件。

調配例 13

將 100 mg 之本化合物溶解於適量丙酮中，以製備溶液，以該溶液浸漬面積為 4.0 cm 見方、厚度為 1.2 cm 多孔性陶瓷片，獲得加熱煙燻調配劑。

調配例 14

以含有本化合物之丙酮溶液浸漬濾紙，使得該濾紙中所含本化合物之濃度為 $1\text{ g}/1\text{ m}^2$ ，藉由空氣風乾濾紙移除丙酮，獲得蟻防治片。

試驗例 1：蚊香捲對普通家蚊(赤家蚊)之效果

以含本化合物之丙酮溶液均勻浸漬蚊香捲用之基質材

(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)

料(藉由攪拌太白粉、除蟲菊渣及木粉之 4:3:3 之混合物，加水至其中，充分捏合所得混合物，經模塑及乾燥該捏合之混合物而製得者)，使該材料含有預定量之本化合物。將所得基質材料風乾，製得蚊香捲。

將 10 隻普通家蚊之雌性成蟲釋放於玻璃室(70 cm 立方公分，容量：0.34 m³)中。將如上文製得之含有本化合物之蚊香捲 0.3 g 置於該室底部中心之支持器上，點燃蚊香之一端，燃燒 30 分鐘後，自該室取出。計算蚊香安置後 15 分鐘內擊倒之普通家蚊數目。

以(1RS)-順式-3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基環丙烷羧酸(S)-2-甲基-4-氧代基-3-(2-丙炔基)-環戊-2-烯酯(下文稱為參考化合物 A)重複相同之試驗步驟。

試驗結果示於表 1。表 1 中擊倒活性係依下述標準評估者：

優異：所有昆蟲皆被擊倒(一共重複 2 次)。

良好：有 1 至 3 隻昆蟲未被擊倒(同上)。

中等：有 4 至 6 隻昆蟲未被擊倒(同上)。

差：有 7 隻或更多昆蟲未被擊倒(同上)。

表 1

試驗化合物	濃度(% W/W)	擊倒活性
本化合物	0.5	優異
參考化合物 A	0.5	差
	1.0	差

試驗例 2

對普通家蚊(赤家蚊)噴霧油性調配劑之效果

(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)

將 10 隻普通家蚊之雌性成蟲釋放於玻璃室(70 立方公分，容量：0.34 m³)中。將 0.7 毫升之依據調配例 7 製得之含有預定量濃度(示於表 2)本化合物之油性調配劑以噴霧槍，經該室之小側窗噴霧至該室中。噴霧 2 分鐘後，計算普通家蚊被擊倒之數目。

以(1RS)-順式-3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基環丙烷羧酸(S)-2-甲基-4-氧代基-3-(2-丙炔基)-環戊-2-烯酯(下文稱為參考化合物 A)重複相同之試驗步驟。

表 2 顯示試驗結果。表 2 中擊倒活性係依下述標準評估者：

良好：有 3 隻或更少昆蟲未被擊倒(一共重複 2 次)。

中等：有 4 至 6 隻昆蟲未被擊倒(同上)。

差：有 7 隻或更多昆蟲未被擊倒(同上)。

表 2

試驗化合物	濃度 (% W/W)	擊倒活性
本化合物	0.025	良好
參考化合物 A	0.025	差
	0.05	差

試驗例 3

對美洲蟑螂之殺昆蟲試驗及對大鼠之毒性--對美洲蟑螂之殺昆蟲試驗

以丙酮分別稀釋本化合物與參考化合物 A，以製備預定濃度之稀釋液。以微型塗佈器，將各稀釋液以每隻昆蟲 1.0 ul 塗佈於美洲蟑螂之雌性成蟲的腹板上。然後供給彼等昆蟲水及食物。72 小時後，計算死亡及存活數。由死

(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)

亡率決定 LD_{50} 值。

--對大鼠之毒性

以玉米油分別將本化合物與參考化合物 A 稀釋至預定濃度。如此製得之各稀釋液以 10 mg/kg 的量投予至大鼠。供給大鼠水及食物。7 天後，計算死亡及存活數。由死亡率決定 LD_{50} 值。

--安全因子之計算

依下述等式，由對美洲蟑螂之殺昆蟲活性及對大鼠之毒性計算安全因子。結果示於表 3。

安全因子 = [對大鼠之毒性 (LD_{50} 值)] / [對美洲蟑螂之殺昆蟲活性 (LD_{50} 值)]

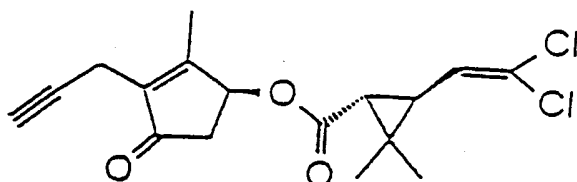
表 3

試驗化合物	對美洲蟑螂之殺昆蟲活性 (LD_{50} 值)	對大鼠之毒性 (LD_{50} 值)	安全因子
本化合物	0.72	>300	>400
參考化合物 A	4.4	<100	<23

本化合物具有優異之害蟲防治效果，且對哺乳安全，因此非常有效地作為防治害蟲用之組成物之活性成分，特別是作為預防傳染病用之防治害蟲用之組成物之活性成分。

四、中文發明摘要(發明之名稱：除蟲菊酯化合物及含有該化合物)
作為活性成分之防治害蟲用組成物

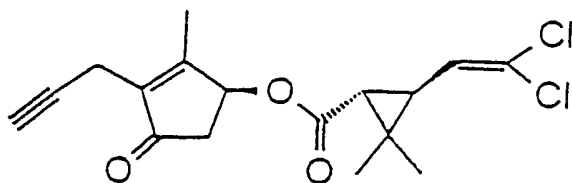
本發明揭示一種下式所示之(1R)-反式-3-(2,2-二氯乙
烯基)-2,2-二甲基環丙烷羧酸(S)-2-甲基-4-氧代基-3-(2-丙
炔基)-環戊-2-烯酯化合物：



該酯類化合物具有優異之害蟲防治效果，且對哺乳類無
害。

英文發明摘要(發明之名稱：PYRETHROID COMPOUND AND COMPOSITION FOR
CONTROLLING PEST CONTAINING THE SAME AS
AN ACTIVE INGREDIENT)

(S)-2-methyl-4-oxo-3-(2-propynyl)-cyclopent-2-
enyl (1R)-trans-3-(2,2-dichlorovinyl)-2,2-
dimethylcyclopropanecarboxylate represented by the formula:



is a compound excellent in controlling effect on insect
pests and harmlessness to mammals.

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

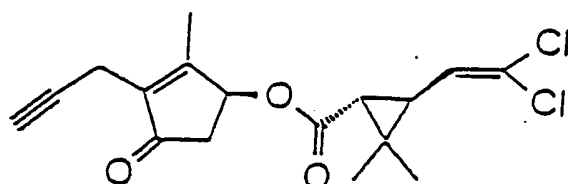
裝

訂

編

六、申請專利範圍

1. 一種下式所示之 (1R)-反式-3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基環丙烷羧酸 (S)-2-甲基-4-氧代基-3-(2-丙炔基)-環戊-2-烯酯：



2. 一種防治節肢動物用之組成物，包括如申請專利範圍第 1 項之化合物作為活性成份及惰性載劑。
3. 一種防治節肢動物之方法，包括將有效量之如申請專利範圍第 1 項之化合物施用於節肢動物之棲息處。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂