

發明專利說明書

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※ 申請案號： 96136081

※ 申請日期： 96. 9. 28

※IPC 分類：

A01N 43/40 (2006.01)

A01N 43/06 (2006.01)

C07D 405/02 (2006.01)

A01P 7/60 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

新穎之結晶修飾

NOVEL CRYSTALLINE MODIFICATION

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

拜耳作物科學股份有限公司

BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT

代表人：(中文/英文)

1. 包亞歷/BADER, AXEL

2. 傑羅夫/JESSE, RALF-RUEDIGER

住居所或營業所地址：(中文/英文)

德國莫罕城艾諾貝耳街 50 號

Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Germany

國 籍：(中文/英文)

德國/Germany

三、發明人：(共 7 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 奧尼克/OLENIK, BRITTA

2. 傑斯卡/JESCHKE, PETER

3. 費爾滕/VELTEN, ROBERT

4. 卡倫坎/GALLENKAMP, BERND

5. 約格斯/JOERGES, WOLFGANG

6. 維米爾/VERMEER, RONALD

7. 皮里奧/PITTA, LEONARDO

國 籍：(中文/英文)

1.-5.及 7.均為德國/Germany

6.為荷蘭/The Netherlands

四、聲明事項：

☐ 主張專利法第二十二條第二項 ☐ 第一款或 ☐ 第二款規定之事實，其事實發生日期為： 年 月 日。

☒ 申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

☒ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

德國；西元 2006 年 9 月 29 日；10 2006 046 161.4

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

國 籍：(中文/英文)

1.-5.及 7.均為德國/Germany

6.為荷蘭/The Netherlands

四、聲明事項：

☐ 主張專利法第二十二條第二項 ☐ 第一款或 ☐ 第二款規定之事實，其事實發生日期為： 年 月 日。

☒ 申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

☒ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

德國；西元 2006 年 9 月 29 日；10 2006 046 161.4

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

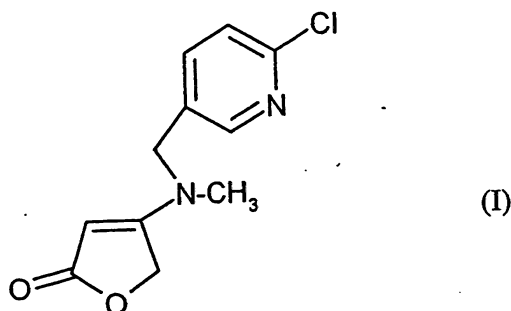
☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

九、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於式(I)化合物之新穎的結晶修飾，其製法及其在農藥製劑中的用途。



【先前技術】

式(I)化合物是已知自 EP-A 0 539 588。其可以經由其中揭示的方法製備。

在先前技藝揭示的合成方法中，得到式(I)化合物之結晶修飾II (命名及鑑定見下面發明說明)。此結晶修飾是亞穩物。

已知對於部分多晶型物，某些修飾在達到熔點之整個溫度範圍是熱動力學安定相，但是在其他物質系統，存在一或多個過渡點其中安定性比例是相反。不可能預測安定性比例且具體地說，也就是上述過渡點之存在及位置。關於這些基本熱動力學關係的先前技藝之回顧文獻是提供在 J. Bernstein, R.J. Davey, J.O. Henck, Angew. Chem. Int. Ed., 1999, 38, 3440-3461。

5 活性化合物在不同結晶修飾(多晶型)之出現，對於制定製備方法及對於發展調配物非常重要。據此，化學化合物之不同結晶修飾不只是外形(晶體習性)及硬度不同，多種其他物理化學形質也不同。關於安定性、可過濾性、可研磨性、溶解性、吸濕性、熔點、固體密度及流動性之差異，對於農作物處理組成物之品質及功效有非常大的影響。迄今還不可能預測結晶修飾之出現及數量，包括其物理化學性質。尤其是無法預先測定熱動力學安定性以及在活的有機體投藥後的不同行為。

10 亞穩的結晶修飾，例如式(I)化合物之結晶修飾II，與熱動力學安定的形式比較，關於活性化合物及調配物之製備方法，以及關於儲存及輸送，通常具有缺點。已知自J. Halebian, W. McCrone, J. Pharm. Sci. 58 (1969) 911，當使用熱動力學亞穩的形式時，在製備或儲存中可能完全或部分轉化成另一種多晶型形式。相關的現象觀察到不欲的晶體生長(再結晶作用)、改變生物利用性、結塊等。該轉化可能進行相當長的時間或自動且無法預期。是否、何時及在何種量下形成另一種結晶修飾，主要是機會問題。亞穩的結晶修飾之此行為，對於發展、輸送且特別是儲存安定性，有很大的影響。

20 而且，已知亞穩的結晶修飾例如式(I)化合物之結晶修飾II，在調配物之製備過程中，特別是彼等調配物其中該活性化合物是存在為固體形式，或在調配物之製備過程中，活性化合物是在某些長度的時間存在為固體形式之情形

下，導致調配物之負面性質。當然，不能排除當使用亞穩的結晶修飾時不可能製備調配物。當製備調配物其中活性化合物是使用固體形式時，通常需要將活性化合物粉末化。此製程是機械性，且因此造成溫度上升。當溫度增加時，活性化合物之亞穩性形式將容易轉化成安定的修飾，其在碾碎過程中可導致膠住。碾碎過程中的膠住係指活性化合物或活性化合物之懸浮液及碾碎介質在碾碎裝置中固化，達到完全硬化。碾碎過程中膠住之風險是受到亞穩性修飾之不可預期的轉化速率影響。即使調配物可以使用亞穩性修飾之活性化合物製備，調配物之儲存經常造成問題，因為在此即使非常低的亞穩性修飾之轉化速率，對於儲存性質有負面的效應。經由此儲存過程的轉化所造成的負面性質實例是晶體生長、粒子結塊、產物之沈澱或固化。

【發明內容】

據此，本發明之目的是提供式(I)化合物之一種新穎之結晶修飾，由於其物理化學性質，調配時可以完善掌握。本發明之另一個目的是製備式(I)化合物之一種新穎之結晶修飾，其特別合適用於製備需要碾碎製程供使用之調配物。作為實例及作為偏好，但不是作為限制，可以列舉下面調配物：調配物其中活性化合物是存在為固體(乾燥)形式，例如：顆粒、膠囊內的顆粒、片劑、水分散性顆粒、水分散性片劑、水分散性粉末或用於種子處理之水分散性粉末、粉劑調配物；調配物其中活性化合物是存在為分散

的形式，例如：懸浮濃縮液、油基質的懸浮濃縮液、懸浮乳化液或用於種子處理的懸浮濃縮液。

根據本發明，此目的是經由式(I)化合物之一種新穎之結晶修飾達成，其在下文稱為結晶修飾I(安定的修飾)。

據此，本發明提供結晶修飾I，其特徵是當使用Cu K α 照射時，其具有下面反射平面之x-光粉末繞射圖(2θ , >20%相對強度)：

$2\theta/^\circ$
16.80
19.58
21.11
21.32
23.23
28.00

根據一個較佳的具體實施例，結晶修飾I之特徵是當使用Cu K α 照射時，其具有下面反射平面之x-光粉末繞射圖(2θ , >20%相對強度)：

$2\theta/^\circ$
16.80
19.58
21.11
21.32
22.92

23.23
23.97
28.00

根據一個更佳的具體實施例，結晶修飾I之特徵是當使用Cu K α 照射時，其具有下面反射平面之x-光粉末繞射圖(2 θ ，>20%相對強度)：

2 θ /°
8.07
15.16
16.80
19.58
20.03
21.11
21.32
22.92
23.23
23.97
24.46
24.54
27.26
27.60
28.00

根據本發明之一個特別較佳的具體實施例，結晶修飾 I 之 x-光粉末繞射圖具有表 1 提供之反射平面。根據本發明之一個更非常特別較佳的具體實施例，結晶修飾 I 之 x-光粉末繞射圖具有圖 1 所示之訊號。據此，結晶修飾 I 之 x-光粉末繞射圖之最強的訊號(2θ)是在：16.80°、19.58°、21.11°、21.32°、22.92°、23.23°、23.97°及 28.00° (在各情形±0.2°)。

全部 x-光粉末繞射法數據是使用下面擷取參數獲得：

- 繞射儀： 穿透
- 單色光鏡： Curved Germanium (III)
- 波長： 1.540598 Cu
- 偵測器： Linear PSD
- 掃描模式： 穿透/移動的 PSD/固定的 Ω
- 掃描種類： 2θ： Ω
- 說明的 2θ： ±0.2°

表 1：

2θ/°	相對強度 ¹
8.07	14
15.16	13
15.51	11
16.25	9
16.80	100
18.02	12

2 θ /°	相對強度 ¹
19.58	30
20.03	18
20.67	8
21.11	26
21.32	21
21.69	9
21.77	9
22.19	9
22.92	20
23.23	48
23.97	20
24.26	11
24.46	17
24.54	14
24.76	8
25.31	8
25.88	6
26.14	7
26.87	12
27.26	13
27.60	18
28.00	45
28.41	11

2 θ /°	相對強度 ¹
28.96	6
29.09	6
29.80	9
30.65	7
31.00	7
31.29	10
31.77	6
32.86	6
33.91	5
34.78	10
35.47	6
35.78	4
36.57	10
36.86	3
37.16	7

¹ 強度相對於圖譜中任意定義為 100 之最強訊號。

式(I)化合物之已知的結晶修飾II之特徵是其X-光粉末繞射圖具有下面表2所列之反射面(2 θ)。結晶修飾II之X-光粉末繞射圖也列在圖2。

表 2：

2 θ /°	相對強度 ¹
12.82	14
13.17	12
14.02	52
15.23	9
15.75	7
16.81	19
17.19	38
18.90	42
19.66	31
19.81	33
20.01	8
20.63	81
21.19	11
21.34	17
22.01	100
22.55	41
22.71	40
22.93	8
23.22	11
23.79	18
23.92	24

2 θ /°	相對強度 ¹
24.54	11
24.83	12
25.16	17
25.81	8
26.18	5
26.44	4
26.84	6
27.01	5
27.33	7
27.59	6
27.97	16
28.26	62
28.52	36
28.79	24
29.31	18
29.53	18
29.67	9
29.79	7
30.62	10
30.82	16
31.30	4
31.53	5
31.78	5

2 θ /°	相對強度 ¹
32.23	6
32.83	6
33.33	4
34.10	4
34.57	13
34.78	13
35.21	7
35.40	6
36.31	6
36.49	4
36.79	9
36.95	7
37.71	4

¹ 強度相對於圖譜中任意定義為 100 之最強訊號。

根據本發明的式(I)化合物之結晶修飾I還可以經由IR及拉曼(Raman)光譜鑑定。

5 據此，本發明還提供式(I)化合物之結晶修飾I，其特徵是具有下面波段[公分⁻¹]之IR光譜：

[公分 ⁻¹]
3122
1584
1055

933
896
800

根據本發明之一個較佳具體實施例，式(I)化合物之結晶修飾I之IR光譜具有表3提供的波段。根據本發明之一個更特別較佳具體實施例，式(I)化合物之結晶修飾I之IR光譜具有圖3所示的訊號。

5 本發明還提供式(I)化合物之結晶修飾I，其特徵是具有下面波段[公分⁻¹]之拉曼光譜：

[公分 ⁻¹]
3047
1719
1601
1342
1254
936

根據本發明之一個較佳具體實施例，式(I)化合物之結晶修飾I之拉曼光譜具有表3提供的波段。根據本發明之一個更非常特別較佳具體實施例，式(I)化合物之結晶修飾I之拉曼光譜具有圖5所示的訊號。

10 式(I)化合物之已知結晶修飾II之特徵是其具有下面表3提供的波段。結晶修飾II之IR光譜及結晶修飾II之拉曼光譜也分別顯示在圖4及圖6。

全部IR光譜是使用下面的擷取參數獲得：

FT-IR 光譜儀

Bruker Tensor 37

鑽石 ATR 單元

從 Specac

波長範圍

550-4000 公分⁻¹

解析度

2 公分⁻¹

掃描數

64

全部拉曼光譜是使用下面的擷取參數獲得：

FT-IR 光譜儀

Bruker RFS/100

雷射波數

15798.7 公分⁻¹

解析度

1 公分⁻¹

掃描數

128

表 3

I	II	I	II
IR 波段 [公分 ⁻¹]	IR 波段 [公分 ⁻¹]	拉曼波段 [公分 ⁻¹]	拉曼波段 [公分 ⁻¹]
800	720	335	183
813	737	409	249
854	749	415	270
896	776	429	288
933	814	457	312
981	830	513	337
990	852	547	387
1006	866	579	415
1030	901	601	428

I	II	I	II
IR 波段 [公分 ⁻¹]	IR 波段 [公分 ⁻¹]	拉曼波段 [公分 ⁻¹]	拉曼波段 [公分 ⁻¹]
1055	918	635	462
1106	948	675	503
1143	989	706	540
1159	1010	709	544
1189	1026	743	580
1227	1048	801	602
1294	1098	815	639
1326	1109	832	680
1343	1141	864	703
1390	1160	900	722
1409	1195	936	738
1434	1212	982	779
1443	1250	1030	814
1458	1288	1056	830
1567	1326	1095	853
1584	1354	1112	869
1713	1395	1142	900
1750	1415	1168	919
1797	1450	1208	950
2906	1505	1226	990
2930	1566	1254	993

I	II	I	II
IR 波段 [公分 ⁻¹]	IR 波段 [公分 ⁻¹]	拉曼波段 [公分 ⁻¹]	拉曼波段 [公分 ⁻¹]
3047	1607	1293	1012
3122	1716	1330	1029
	1802	1342	1046
	2816	1391	1092
	2871	1410	1098
	1932	1443	1110
	2953	1466	1141
	3010	1568	1167
	3058	1585	1212
	3078	1601	1222
	3126	1679	1233
		1705	1250
		1719	1288
		1794	1293
		2678	1338
		2831	1355
		2869	1418
		2907	1449
		2930	1464
		2952	1568
		2961	1584

I	II	I	II
IR 波段 [公分 ⁻¹]	IR 波段 [公分 ⁻¹]	拉曼波段 [公分 ⁻¹]	拉曼波段 [公分 ⁻¹]
		2985	1619
		3047	1706
		3070	2816
		3122	2873
			2934
			2952
			3057
			3067
			3126
			3168

訝異地，經發現在結晶修飾I之式(I)化合物是熱動力學上安定且不會轉化成另一種結晶修飾，即使是在長時間儲存。而且，還發現與其他結晶修飾比較，結晶修飾I容易粉末化/研碾，且使用此修飾製備的調配物即使長時間儲存也安定。如此使得可以製備懸浮濃縮液、油基質的懸浮濃縮液及例如水分散性顆粒以及類似的調配物用於處理種子。此外，與結晶修飾II比較，結晶修飾I降低吸收大氣溼氣的傾向。基於這些理由，其非常合適用於製備固體調配物。由於其安定性，其給與這些調配物所要的長期儲存安定性。使用結晶修飾I，據此可能在定義且標靶的方式下製備式(I)化合物之安定固體製劑。

由於其安定性，在結晶修飾I之式(I)化合物非常合適用於製備組成物供控制害蟲。據此，本發明也提供組成物用於控制害蟲，其含式(I)化合物的結晶修飾I本身或作為與佐劑及載劑之混合物，以及與其他活性化合物之混合物。

本發明也包括含式(I)化合物的結晶修飾I及結晶修飾II之組成物。較宜使用含低於20重量%的式(I)化合物的結晶修飾II之組成物，特別較宜低於15重量%，非常特別較宜低於10重量%，尤其較宜低於5重量%，最宜低於4、3、2或1重量%的式(I)化合物的結晶修飾II用於調配物。

較佳的組成物是含從約80至約100重量%的式(I)化合物的結晶修飾I及從約20至約0重量%的式(I)化合物的結晶修飾II。特別較佳的組成物是含從約85至約100重量%的式(I)化合物的結晶修飾I及從約15至約0重量%的式(I)化合物的結晶修飾II。非常特別較佳的組成物是含從約90至約100重量%的式(I)化合物的結晶修飾I及從約10至約0重量%的式(I)化合物的結晶修飾II。特殊較佳的組成物是含從約95至約100重量%的式(I)化合物的結晶修飾I及從約5至約0重量%的式(I)化合物的結晶修飾II。最佳的組成物是含從約96至約100重量%的式(I)化合物的結晶修飾I及從約4至約0重量%的式(I)化合物的結晶修飾II或從約97至約100重量%的式(I)化合物的結晶修飾I及從約3至約0重量%的式(I)化合物的結晶修飾II或從約98至約100重量%的式(I)化合物的結晶修飾I及從約2至約0重量%的式(I)化合物的結晶

修飾II或從約99至約100重量%的式(I)化合物的結晶修飾I及從約1至約0重量%的式(I)化合物的結晶修飾II。

5 本發明也提供用於控制害蟲之組成物，該組成物含在結晶修飾I之式(I)化合物及至少一種形式不同於結晶修飾I之式(I)化合物。不同於結晶修飾I之式(I)化合物的形式實例是結晶修飾II及無定形的形式。調配物中使用的活性化合物品質較宜是含低於20重量%不同於式(I)化合物的結晶修飾I之式(I)化合物形式，特別較宜是低於10重量%，非常特別較宜是低於5重量%且最宜是低於2重量%不同於式
10 (I)化合物的結晶修飾I之式(I)化合物形式。

由於其安定性，式(I)化合物的結晶修飾I是相當普遍合適作為起始物質使用供製備含式(I)化合物之任何組成物用於控制害蟲，即使如果調配後，式(I)化合物不再存在是結晶修飾(I)，而是例如在溶解的形式。

15 據此，本發明還提供使用式(I)化合物的結晶修飾I製備用於控制害蟲的組成物之方法及含式(I)化合物用於控制害蟲之組成物，該組成物是得自式(I)化合物的結晶修飾I。經由使用式(I)化合物的結晶修飾I，增加式(I)化合物的製劑之安全，並因此降低劑量錯誤之風險。

20 式(I)化合物的結晶修飾I可以在已知的方式下轉化成慣用的調配物，例如懸浮濃縮物、油基質的懸浮濃縮物、膠體的濃縮物、可分散的濃縮物、可乳化的濃縮物(乳液濃縮物)、乳液種子敷料、懸浮液種子敷料、粒劑、微粒劑、懸浮乳液、水溶性粒劑、水溶性濃縮物及水分散性粒

劑、使用合適的佐劑及載劑或溶劑。在此，活性化合物必須存在的濃度是從約0.5至90 %的總混合物重量，也就是足以達到所要的劑量程度之量。製備調配物是例如經由用水、溶劑及/或載劑將式(I)化合物之結晶修飾I膨脹，如果適當時使用乳化劑及/或分散劑、及/或其他佐劑例如滲透劑。

當製備懸浮液濃縮物時，即使是用於處理種子者，除了活性化合物及膨脹劑(水、溶劑或油)之外，通常還加入佐劑。為了溼潤在連續相中的活性化合物是使用溼化劑，為了安定在液相中的懸浮液是使用分散劑，為了乳化非水性層是將乳化劑用於溶劑或油的懸浮濃縮物。如果需要時，摻混抗凍劑、殺蟲劑、稠化劑、染劑、散播劑及/或促進攝取劑。

式(I)化合物之結晶修飾I可以得自下面說明的方法。

加入其中式(I)化合物之結晶修飾II是以懸浮液之形式存在之合適溶劑後，在攪拌下將在結晶修飾II之式(I)化合物(4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](甲基)胺基}呋喃-2(5H)-酮，得知自EP-A 0 539 588；穩定修飾)溫熱至約80°C(溫和)並在此溫度攪拌約1或更多小時。將樣本放在未加熱的區隔中過夜。如此得到在結晶修飾I之式(I)化合物(穩定修飾)。

在一個替代方法中，將在結晶修飾II之式(I)化合物(4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](甲基)胺基}呋喃-2(5H)-酮，得知自EP-A 0 539 588；穩定修飾)在攪拌下在合適的溶劑例

如醋酸丁酯或甲苯中煮沸，並在迴流溫度(90-120℃)攪拌1-12小時。將加熱關閉，在攪拌下使混合物冷卻並在約90-110℃加入少量在結晶修飾I之式(I)化合物(穩定修飾，根據實例1獲得)。到達室溫後，將產物吸氣過濾並用合適的溶劑例如石油醚、甲苯、己烷、庚烷或環己烷清洗，將殘留物在30-60℃的真空乾燥箱內乾燥。如此得到90-95%在結晶修飾I之式(I)化合物(穩定修飾)及5-10%在結晶修飾II之式(I)化合物(穩定修飾)。

上述用於製備式(I)化合物之結晶修飾I的方法之特定具體實施例是揭示在實例1、1.1及1.2。

根據本發明之活性化合物，組合良好植物耐受性及對溫血動物之合適毒性及環境度耐受良好，合適用於保護植物及植物器官、用於增加收穫產量、用於改進收穫的物質之品質及用於控制動物害蟲，特別是昆蟲、蜘蛛綱的節肢動物、蠕蟲、線蟲及軟體動物，其係在農業、園藝、動物飼養、森林、花園及休閒設施、儲存的產品及物質之保護、及衛生部門中遭遇。其較宜作為植物保護劑使用。其可活性對抗一般敏性及抵抗性物種及對抗全部或部分階段的發育。上述害蟲包括：

從虱目例如恙蟲科、盲虱科、長顎虱科、虱科、羽虱科。

從蛛形綱目例如粗腳粉蟎、桔芽癭蟎、刺皮癭蟎科、刺癭蟎科、花蜱科、隱啄蜱科、方頭蜱科、短鬚蟎科、苜蓿苔蟎、癢蟎科、雞皮刺蟎、東方葉蟎科、梨葉銹蟎、橘

真葉蟎科、癭蟎科、半亂跗線蟎科、璃眼蜉科、蜉科、黑寡婦球腹蛛、榆後葉蟎科、小瓜蟎科、耳殘啄蜉科、全爪蟎科、橘銹蟎、側多食跗線蟎、恙蟎科、血紅扁頭蜉科、根蟎科、疥蟎科、*Scorpio maurus*、*Stenotarsonemus* spp.、跗線蟎科、紅葉蟎科、背瘤癭蟎。

從二瓣目例如 *Dreissena* spp.。

從唇足亞綱目例如 *Geophilus carpophagus* 及蛸蛭種。

從鞘翅目例如大豆象、麗金龜科、*Agelastica alni*、叩甲科、金龜子、*Anobium punctatu*、天牛科、花象甲科、皮蠹科、*Apogonia* spp.、*Atomaria* spp.、黑皮蠹科、豆象、豆象科、象甲科、*Cleonus mendicus*、金針蟲科、蛀基象甲科、*Costelytra zealandica*、*Curculio* spp.、柳小隱啄象甲、皮蠹科、*Diabrotica* spp.、瓢蟲科、*Fausinus cubae*、麥珠甲、*Heteronychus arator*、*Hylamorpha elegans*、*Hylotrupes bajulus*、*Hypera postica*、小蠹科、*Lachnosterna consanguinea*、*Leptinotarsa decemlineata*、稻象甲、大黃象甲科、竹粉蠹科、*Meligethes aeneus*、*Melolontha melolontha*、*Migdolus* spp.、天牛科、*Naupactus xanthographus*、*Niptus hololeucus*、*Oryctes rhinoceros*、鋸谷盜、*Otiorrhynchus sulcatus*、銀點花金龜、*Phaedon cochleariae*、*Phyllophaga* spp.、日本麗金龜、*Premnotrypes* spp.、油菜蘭跳甲、蛛甲科、黑根瓢蟲、*Rhizopertha dominica*、米象科、谷象科、*Sternechus* spp.、*Symphytetes* spp.、黃粉甲、擬谷稻科、斑皮蠹科、*Tychius* spp.、虎天牛科、步甲科。

從彈尾目例如 *Onychiurus armatus*。

從革翅目例如歐洲球蠖。

從二足目例如 *Blaniulus guttulatus*。

從雙翅目例如伊蚊科、按蚊科、*Bibio hortulanus*、
5 *Coliphora erythrocephala*、地中海實蠅、葉甲科、螺旋蠅
科、*Cordylobia anthropophaga*、庫蚊科、疽蠅科、油橄欖
實蠅、人膚蠅、果蠅科、廢蠅科、*Gastrophilus* spp.、種蠅
科、*Hyppobosca* spp.、皮蠅科、潛蠅科、絲光綠蠅科、家
蠅科、*Nezara* spp.、鼻蠅科、瑞典蠅、甜菜潛葉蠅、*Phorbia*
10 spp.、螫蠅科、虻科、*Tannia* spp.、歐洲大蚊、*Wohlfahrtia*
spp.。

從腹足綱例如蛞蝓科、*Biomphalaria* spp.、*Bulinus* spp.
、灰蛞蝓科、*Galba* spp.、*Lymnaea* spp.、*Oncomelania* spp.
、*Succinea* spp.。

15 從蠕蟲綱例如十二指腸鉤蟲、錫蘭鉤蟲、巴西鉤蟲、
鉤蟲科、人蛔蟲、蛔蟲科、馬來絲蟲、帝汶思蟲、
Bunostomum spp.、夏氏線蟲科、支睪吸蟲科、古柏線蟲科
、雙腔吸蟲科、網尾線蟲、闊節裂頭絛蟲、麥地那龍線蟲
、細粒棘球絛蟲、多房型棘球絛蟲、蟯蟲、片形吸蟲科、
20 血矛線蟲科、異刺線蟲科、短膜殼絛蟲、豬圓形線蟲科、
羅阿絲蟲、細頸線蟲科、結節線蟲科、後睪吸蟲科、旋盤
尾絲蟲、奧氏線蟲科、并殖吸蟲科、裂體吸蟲科、
Strongyloides fuelleborni、糞類圓線蟲、類圓線蟲科、牛
肉絛蟲、豬肉絛蟲、旋毛蟲、*Trichinella nativa*、*Trichinella*

britovi、*Trichinella nelsoni*、*Trichinella pseudopsiralis*、毛圓線蟲科、鞭形鞭蟲、班氏線蟲。

其還可能控制原生動物門例如艾美蟲。

從異翅亞目例如南瓜緣蝽、*Antestiopsis* spp.、長蝽科、*Calocoris* spp.、*Campylomma livida*、*Cavelerius* spp.、臭蟲科、*Creontiades dilutus*、*Dasynus piperis*、*Dichelops furcatus*、*Diconocoris hewetti*、紅蝽科、褐蝽科、褐盾蝽科、*Heliopeltis* spp.、*Horcias nobilellus*、蛛緣蝽科、葉足緣蝽、盲蝽科、*Macropes excavatus*、盲蝽科、綠蝽科、盾蝽科、烏葉蟬科、甜菜擬網蝽、*Piezodorus* spp.、*Psallus seriatus*、*Pseudacysta perseae*、*Rhodnius* spp.、*Sahlbergella singularis*、黑蝽科、梨花網蝽、*Tibraca* spp.、臭吸血獵蝽科。

從同翅目例如無網長管蚜科、*Aeneolamia* spp.、*Agonoscena* spp.、粉虱科、甘蔗粉虱、棉粉虱科 *Amrasca* spp.、李薊圓尾蚜、圓蚧科、*Aphanostigma piri*、蚜科、*Arboridia apicalis*、*Aspidiella* spp.、圓蚧科、*Atanus* spp.、馬鈴薯長鬚蚜、粉虱科、桃短尾蚜、短體蚜科、甘藍蚜、*Calligypona marginata*、*Cameocephala fulgida*、甘蔗綿蚜、沫蟬科、蠟蚧科、草莓毛管蚜、蔗黃雪盾蚧、*Chlorita onukii*、胡桃黑斑蚜、茶褐圓蚧、*Cinadulina mbila*、*Coccoomytilus halli*、蚧科、茶薺隱瘤額蚜、*Dalbulus* spp.、粉虱科、*Diaphorina* spp.、盾蚧科、*Doralis* spp.、綿蚧科、圓尾蚧科、灰粉蚧科、微葉蟬科、綿蚜科、斑葉蟬科

、*Euscelis bilobatus*、*Geococcus coffeae*、*Homalodisca*
coagulata、桃大尾蚧、吹綿蚧科、夜蟬科、*Idioscopus* spp.
 、稻灰飛虱、蠟蚧科、蠣蚧科、蘿蔔蚧、長管蚧科、*Mahanarva*
fimbriolata、*Melanaphis sacchari*、*Metcalfiella* spp.、薔薇
 5 麥蚧、*Monellia costalis*、*Monelliopsis pecanis*、瘤額蚧科
 、萵苣蚧、黑尾葉蟬科、褐稻虱、*Oncometopia* spp.、*Orthezia*
praelonga、檉柳粉虱、番茄木虱科、黑點蚧科、瘿綿蚧科
 、菲島玉米蠟蟬、粉蚧科、*Phloeomyzus passerinii*、*Phorodon*
humuli、*Phylloxera* spp.、橘長盾蚧、橘粉蚧科、
 10 *Protopulvinaria pyriformis*、桑白蚧、*Pseudococcus* spp.、
 木虱科、*Pteromalus* spp.、蔗飛虱科、圓蚧科、*Quesada gigas*
 、*Rastrococcus* spp.、縊管蚧、盔蚧、*Scaphoides titanus*、
Schizaphis graminum、*Selenaspidus articulatus*、*Sogata* spp.
 、白背飛虱飛虱科、*Stictocephala festina*、*Tenalaphara*
 15 *malayensis*、核桃黑蚧、*Tomaspis* spp.、二分山蚧、溫室
 白粉虱、木虱科、小葉蟬、矢尖蚧、葡萄根瘤蚧。

從膜翅目例如葉蜂科、*Hoplocampa* spp.、*Lasius* spp.
 、廚蟻、*Vespa* spp.。

從等足目例如 *Armadium vulgare*、*Oniscus aselus*、
 20 *Porcellio scaber*。

從等翅目例如白蟻科、*Odontotermes* spp.。

從鱗翅目例如 *Acronicta major*、*Aedia leucomelas*、地
 老虎科、*Alabama argillacea*、夜蛾科、*Barathra brassicae*
 、棉葉穿孔潛蛾、尺蠖、*Cacoecia podana*、*Capua reticulana*

、*Carpocapsa pomonella*、*Cheimatobia brumata*、禾螟科、*Choristoneura fumiferana*、*Clysia ambiguella*、*Cnaphalocerus* spp.、埃及金剛鑽、*Ephestia kuehniella*、*Euproctis chrysorrhoea*、切根蟲科、*Feltia* spp.、*Galleria mellonella*、*Helicoverpa* spp.、夜蛾科、*Hofmannophila pseudospretella*、*Homona magnanima*、*Hyponomeuta padella*、甜菜夜蛾科、*Lithocolletis blancardella*、綠果夜蛾、白豆緣切根蟲、毒蛾科、幕毛蟲、甘藍夜蛾、*Mocis repanda*、*Mythimna separata*、*Oria* spp.、稻負泥蟲、*Panolis flammea*、紅鈴蟲、*Phyllocnistis citrella*、菜粉蝶科、小菜蛾、黏蟲科、東方黏蟲科、大豆夜蛾、*Pyrausta nubilalis*、*Spodoptera* spp.、*Thermesia gemmatilis*、網衣蛾、袋衣蛾、*Tortrix viridana*、*Trichoplusia* spp.。

從直翅目例如家蟋蟀、東方蜉蝣、德國小蠊、螻蛄種、馬得拉蜉蝣、飛蝗科、熱帶飛蝗科、美洲大蠊、蚱蜢。從蚤目例如東方鼠蚤科、禽蚤。

從綜合綱目例如 *Scutigera immaculata*。

從櫻翅目例如稻薊馬、*Enneothrips flavens*、褐薊馬科、黑薊馬科、溫室條薊馬、*Kakothrips* spp.、*Rhipiphorothrips cruentatus*、香蕉黃薊馬、*Taeniothrips cardamoni*、薊馬科。

從雙尾目例如西洋衣魚。

植物寄生線蟲包括例如 *Anguina* spp.、*Aphelenchoides* spp.、*Belonoaimus* spp.、*Bursaphelenchus* spp.、*Ditylenchus*

dipsaci、Globodera spp.、Heliocotylenchus spp.、Heterodera spp.、Longidorus spp.、Meloidogyne spp.、Pratylenchus spp.、Radopholus similis、Rotylenchus spp.、Trichodorus spp.、Tylenchorhynchus spp.、Tylenchulus spp.、Tylenchulus semipenetrans、Xiphinema spp.。

如果適當時，根據本發明之化合物在某些濃度及應用率下，也可使用作為除草劑、安全劑、生長調節劑或改良植物性質的藥劑，或作為殺微生物劑例如作為殺真菌劑、抗霉菌劑、殺菌劑、殺類病毒劑(包括對抗類病毒的藥劑)或作為對抗MLO (類黴漿菌的有機體)及RLO (類立克次氏體的有機體)。如果適當時，其也可以作為用於合成其他活性化合物之中間物或前驅物使用。

該活性化合物可以轉化成慣用的調配物，例如溶液、乳液、可溼化的粉末、水及油基質的懸浮液、粉末、撲劑、糊劑、可溶解的粉末、可溶解的粒劑、用於散播的粒劑、懸浮液-乳液濃縮物、摻混活性化合物之天然物質、摻混活性化合物之合成物質、肥料及在聚合物質中的微囊狀物。

這些調配物是在已知的方法下生產，例如將活性化合物與增量劑混合，其係液體溶劑及/或固體載劑，隨意地使用表面活性劑，其係乳化劑及/或分散劑及/或泡沫形成劑。該調配物是在合適的裝置中或在施加前或施加中製備。

合適作為佐劑使用的物質是賦予組成物本身及/或衍生自其之製劑(例如噴霧液體、種子敷料)有特定的性質例

如某些技術性質及/或特殊的生物性質。典型的合適佐劑是：
：增量劑、溶劑及載劑。

合適的增量劑是例如水、極性及非極性有機化學液體，
，例如從芳族及非芳族烴類(例如鏈烷烴、烷基苯、烷基
5 萘、氯苯)、醇類及多元醇類(其如果適當時，也可經取代
、醚化及/或酯化)、酮類(例如丙酮、環己酮)、酯類(包括
脂肪及油)及(聚)醚類、未經取代及經取代的胺類、鹽胺類
、內鹽胺類(例如N-烷基吡咯酮類)及內酯類、砜及亞砜(
例如二甲亞砜)。

如果增量劑是使用水，也可以使用例如有機溶劑作為
10 輔助溶劑，實質上，合適的液體溶劑是：芳香族例如二甲
苯、甲苯或烷基萘，氯化芳香族或氯化脂族烴類例如氯苯
、氯乙烯或二氯甲烷，脂族烴類例如環己烷或鏈烷烴例如
石油餾份、礦物及植物油，醇類例如丁醇或乙二醇及其醚
15 類及酯類，酮類例如丙酮、甲乙酮、甲基異丁基酮或環己
酮，強極性溶劑例如二甲基甲鹽胺及二甲亞砜或水。

根據本發明，載劑是天然或合成的有機或無機物質，
其可以是固體或液體且活性化合物可以和其混合或結合
而有較佳的應用性，特別是應用至植物或植物的部分或種
20 子，通常，該固體或液體載劑是惰性且可在農業上使用。
合適的固體載劑是：

例如銨鹽及天然礦物粉例如高嶺土、黏土、滑石、石
灰、石英、矽鎂土、蒙脫土或矽藻土，及合成礦物粉例如
微細分粒的二氧化矽、氧化鋁及矽酸鹽；用於粒劑之合適

的固體載劑是：例如粉碎及分級的天然礦石例如方解石、
 大理石、浮石、海泡石及白雲石，或者是無機及有機粉之
 合成顆粒，及有機物例如木屑、椰子殼、玉米梗及棉花莖
 之顆粒；合適的乳化劑及/或泡沫形成劑是：例如非離子性
 及陰離子性乳化劑，例如聚氧乙烯脂肪酸酯類、聚氧乙烯
 脂肪醇醚類例如烷基芳基聚乙二醇醚類、磺酸烷酯、硫酸
 烷酯、磺酸芳酯或蛋白質水解物；合適的分散劑是非離子
 性及/或離子性物質，例如從醇-POE-及/或-POP醚類、酸及
 /或POP-POE酯類、烷基芳基及/或POP-POE醚類、脂肪-及
 /或POP-POE加成物、POE-及/或POP-多元醇衍生物、POE-
 及/或POP-山梨糖醇酐-或-糖加成物、硫酸烷酯或芳酯、烷
 基-或芳基硫酸酯類及磷酸烷酯或芳酯或對應的PO-醚加
 成物。而且，合適的寡聚-或聚合物，例如衍生自乙烯單
 體、自丙烯酸、自EO及/或PO本身或結合例如(聚)醇類或
 (聚)胺類者。也可以使用木質素及其磺酸衍生物、未修飾
 及修飾的纖維素、芳族及/或脂族磺酸及其與甲醛之加成物
 。

在調配物中可以使用膠黏劑例如羧甲基纖維素、粉末
 、顆粒或晶格形式之天然及合成的聚合物，例如阿拉伯膠
 、聚乙烯醇及聚醋酸乙烯酯，或天然磷脂體例如腦磷脂及
 卵磷脂及合成的磷脂體。

也可以使用染劑例如無機顏料，例如氧化鐵、氧化鈦
 及普魯士藍，及有機染料例如茜素染料、偶氮染料、及金
 屬酞菁染料，及微量營養劑例如鐵、錳、硼、銅、鋅、鉬

及鋅之鹽類。

其他可能的添加劑是香水、礦物或植物隨意地經修飾之油類、蠟及營養物(包括微量的營養物)，例如鐵、錳、硼、銅、鈷、鉬及鋅之鹽類。

5 也可以存在安定劑，例如低溫安定劑、防腐劑、抗氧化劑、光安定劑或改良化學及/或物理安定性的其他藥劑。

從商業化調配物製備的使用形式之活性化合物含量可以在大範圍內變化，用於控制動物害蟲例如昆蟲及蟎的使用形式之活性化合物濃度可以是從0.00000001至97%活性化合物之重量，較宜在從0.0000001至97重量%之範圍內，特別較宜在從0.000001至83重量%或0.000001至5重量%之範圍內且非常特別較宜在從0.0001至1%重量之範圍內。

根據本發明之活性化合物組合物在商業化調配物及在從這些調配物製備之使用形式中，可以與其他活性化合物存在為混合物，例如殺昆蟲劑、吸引劑、消毒劑、殺菌劑、殺蟎劑、殺線蟲劑、殺真菌劑、生長調節劑、或除草劑、安全劑、肥料或半化學品。

15 也可能是與其他已知的活性化合物例如除草劑、肥料、生長調節劑、安全劑、半化學品或改良植物性質的其他藥劑之混合物。

20 當作為殺昆蟲劑使用時，根據本發明之活性化合物可另外存在為其商業上供應的調配物及從這些調配物與協乘劑製備成混合物之使用形式，協乘劑是可增加活性化合物活性之化合物活性化合物本身並非必要添加協乘劑。

當作為殺昆蟲劑使用時，根據本發明之活性化合物可另外存在為其商業上供應的調配物及從這些調配物與抑制劑製備成混合物之使用形式，該抑制劑減少活性化合物植物附近、植物部分之表面或植物組織後之分解。

5 從商業上供應的調配物製備的使用形式之活性化合物含量可在大範圍內變化，使用形式之活性化合物濃度可從0.0000001至95重量%之活性化合物，較宜是0.0001及1重量%之間。

該化合物是在合適於使用形式之慣用方式下使用。

10 整個植物及植物部分可根據本發明處理，在本文中的植物係指全部的植物及植物數例如需要及不需要的野生植物或農作物(包括自然出生的農作物)，農作物可以是經由傳統植物培育及最適化方法或經由生物技術及再重組的方法或經由這些方法組合所得之植物，包括基因轉移的植物且包括植物培育者權利保護或不保護的植物栽培品
15 系，植物部分係指地面上及地面下的植物全部部分及器官，例如芽、葉、花及根，可舉例的是葉子、針葉、柄、莖、花、果實體、果實、種子、根、塊莖及根莖，植物部分也包括收成的物質，及生長及生殖繁植物質，例如插條、
20 塊莖、根莖、短匐莖及種子。

根據本發明用活性化合物處理植物及植物部分是經由慣用處理方法直接進行或使化合物作用在其周圍、環境或儲存空間，例如經由浸漬、噴灑、蒸發、霧化、散播、塗敷，且在繁植物質之情形，尤其是種子之情形，也經由

施加一或多個塗層。

可以根據本發明處理的植物之實例是如下：棉花、亞
 麻、葡萄藤、水果、蔬菜，例如薑科(例如梨果，例如
 蘋果及梨子，以及核果，例如杏樹、櫻桃、杏仁及桃子，
 5 及漿果，例如草莓)、Ribesioideae sp.、胡桃科、樺木科、
 漆樹科、山毛櫸科、桑科、木犀科、獼猴桃科、樟科、芭
 蕉科(例如香蕉樹及種植園)、茜草科(例如咖啡)、茶科、
 梧桐科、假葉樹科(例如檸檬、橘子及葡萄柚)；茄科(例如
 番茄)、百合科、Asteraceae sp. (例如萵苣)、繖形科、十字
 10 花科、藜科、葫蘆科(例如黃瓜)、Alliaceae sp. (例如歐洲
 韭、洋蔥)、Papilionaceae sp. (例如豌豆)；主要有價值的植
 物例如禾本科(例如玉米、草坪、穀類例如小麥、裸麥、
 米、大麥、燕麥、高粱、雜糧及黑小麥)、Asteraceae sp. (。
 例如向日葵)、Brassicaceae sp. (例如白高麗菜、紅高麗菜、
 15 青椰菜、花椰菜、蘆筍、小白菜、球莖甘藍、小紅蘿蔔、
 以及油料種子葡萄、芥菜、辣根及芹菜)、Fabaceae sp. (例
 如豆、花生)、Papilionaceae sp. (例如大豆)、茄科(例如馬
 鈴薯)、藜科(例如甜菜、飼料用甜菜、牛皮菜、甜菜根)
 ；在花園及森林中的有價值植物及裝飾植物；且在各情形
 20 下泛指這些植物之基因改良種。

根據本發明用活性化合物組合物處理植物及植物部
 分是經由慣用的處理方法直接或經由處理其環境、處所或
 儲存空間而進行，例如經由浸泡、噴灑、蒸發、蒙上薄霧
 、散播、塗上，且在繁殖物質的情形，特別是種子，還經

由塗上一或多層。

根據本發明之混合物特別合適用於處理種子。根據本發明之較佳組合物在此情形是上述提到的較佳或特別較佳的組合物。據此，害蟲造成的大部分對農作物的傷害是發生在早至當種子是在儲存中繁殖及種子放入土壤後，以及植物開始發芽及發芽期間。這些過程特別重要，因為植物生長的根及芽是特別敏感且即使是很小的傷害也可導致整株植物死亡。經由使用合適的組成物保護種子及發芽的植物因此特別有價值。

經由處理植物的種子控制害蟲已知有很長的時間且是持續改進的目標。但是，種子之處理有一系列的問題其無法都可由傳統的方法解決。據此，在植物播種或發芽後額外實施農作物保護組成物時，需要研發方法用以保護種子及發芽的植物。因此需要將活性化合物的使用量最佳化，用以對種子及發芽的植物提供最佳化的保護而避免害蟲的攻擊，且不會使植物本身受到使用的活性化合物傷害。具體地說，用於處理種子的方法也必須考量基因轉移植物之本質殺蟲性質，以便使用最少量的農作物保護組成物達到種子及發芽植物之最佳化保護。

本發明因此特別也關於用於經由使用根據本發明的組成物處理種子，保護種子及發芽的植物防止受到害蟲攻擊之方法。本發明也關於使用根據本發明的組成物處理種子用於保護種子及所得的植物防止害蟲。而且，本發明還關於經由使用根據本發明的組成物處理而得到保護防止

害蟲之種子。

5 本發明之其中一個優點是根據本發明的組成物之特別系統性性質係指種子用這些組成物處理後，不只保護種子本身，還可保護發芽後所得的植物防止害蟲。在此方式下，農作物可以在播種時立即處理或播種後短時間內處理。

10 另一個優點是與個別的殺蟲活性化合物比較，根據本發明的組成物之協乘增加殺蟲活性超越兩種活性化合物個別實施時的預期活性。再另一個優點是與個別的殺真菌活性化合物比較，根據本發明的組成物之協乘增加殺真菌活性超越兩種活性化合物個別實施時的預期活性。此使得活性化合物的使用量得到最佳化。

15 而且，必須考量是優點的是根據本發明之混合物也可以使用在特別是基因轉移的種子，從此種子產生的植物可以表達直接對抗害蟲之蛋白質。經由使用根據本發明的組成物處理此種子，僅經由表達例如殺蟲性蛋白質就可控制某些害蟲，且另外，根據本發明的組成物提供保護防止傷害。

20 根據本發明的組成物合適用於保護上述用在農業、溫室、森林或園藝中的任何植物種類之種子。具體地說，此包括玉米、花生、油菜、油料種子葡萄、罌粟、大豆、棉花、甜菜屬各種植物(例如甜菜及飼料用甜菜)、米、高粱及雜糧、小麥、大麥、燕麥、裸麥、向日葵、煙草、馬鈴薯或蔬菜(例如番茄、甘藍)之種子形式。根據本發明的組

成物同樣合適用於處理上述提過的水果植物及蔬菜之種子。玉米、大豆、棉花、小麥及油菜或油料種子葡萄的種子之處理特別重要。

5 已經提過，使用根據本發明的組成物處理基因轉移的種子也特別重要。此包括原則上含至少一種異種基因其控制具有特定殺蟲性質的多肽之表達的植物之種子。關於此點，在基因轉移的種子內之異種基因可以衍生自微有機體例如桿狀細菌、根瘤菌、假單胞菌、沙雷氏菌、木霉菌、蕃茄細菌性潰瘍病菌、繡球菌或膠狀青霉菌。本發明特別
10 合適用於處理基因轉移的種子其含至少一種源自桿狀細菌的異種基因且其基因產物顯示對抗歐洲玉米蛀蟲及/或玉米根寄生蟲之活性。其特別是衍生自蘇雲金芽孢桿菌的異種基因。

15 在本發明之範圍內，根據本發明之組成物是獨自或在合適的調配物中施加至種子。種子較宜在處理過程中足夠安定以避免傷害的狀態下處理。通常，種子可以在收成及播種之間的任何時間點處理。通常使用的種子是從植物分離且沒有玉米穗軸、殼、莖、覆蓋物、毛或水果的果肉。

20 當處理種子時，通常必須小心選擇根據本發明的組成物施加至種子的量及/或其他添加物的量，使得不會負面影響種子的發芽，或所得的植物沒有受到傷害。此點必須記在心裡，尤其是活性化合物在某些施加率下具有危害植物的效應之情形下。

根據本發明的組成物可以直接施加，也就是說沒有其

他成分且沒有稀釋。原則上，較宜在合適的調配物之形式下將組成物施加至種子。用於處理種子的合適調配物及方法是從事此藝者已知且揭示在例如下面文獻：US 4,272,417 A、US 4,245,432 A、US 4,808,430 A、US 5,876,739 A、US 2003/0176428 A1、WO 2002/080675 A1、WO 2002/028186 A2。

可以根據本發明使用的活性化合物可以轉化成慣用的種子敷料調配物，例如溶液、乳液、懸浮液、粉劑、泡沫、漿劑或用於種子的其他塗覆物質，以及ULV調配物。

這些調配物是在已知的方法下製備，經由將活性化合物與慣用的添加劑例如慣用的增量劑以及溶劑或稀釋劑、染劑、溼化劑、分散劑、乳化劑、抗發泡劑、防腐劑、第二種稠化劑、黏著劑、赤黴素以及水。

可以存在於可根據本發明使用的種子敷料調配物中的合適染劑包括慣用於此目的之全部染劑。使用可以經由低水溶性的顏料及溶於水的染料進行。可以列舉的實例包括在Rhodamine B, C.I. Pigment Red 112及C.I. Solvent Red I所選用的已知染料。

可以存在於可根據本發明使用的種子敷料調配物中的合適溼化劑包括促進溼潤且慣用於活性農藥化合物的調配物之全部物質。例如可以使用烷基萘磺酸鹽，例如二異丙基-或二異丁基萘磺酸鹽。

可以存在於可根據本發明使用的種子敷料調配物中的合適分散劑及/或乳化劑包括慣用於活性農藥化合物的

調配物之全部非離子性、陰離子性及陽離子性分散劑。例如可以使用非離子性或陰離子性分散劑或非離子性或陰離子性分散劑之混合物。特別合適的非離子性分散劑是環氧乙烷-環氧丙烷嵌狀聚合物、烷基酚聚乙二醇醚類、及三甲苯基酚聚乙二醇醚類，及其磷酸化或硫酸化的衍生物。特別合適的陰離子性分散劑是木質素磺酸鹽、聚丙烯酸鹽及芳基磺酸鹽-甲醛縮合物。

可以存在於可根據本發明使用的種子敷料調配物中的合適抗發泡劑包括慣用於活性農藥化合物的調配物之全部抑制發泡的物質。例如可以使用矽酮去發泡劑及硬脂酸鎂。

可以存在於可根據本發明使用的種子敷料調配物中的合適防腐劑包括在農藥組成物中用於此目的之全部物質。例如二氯酚及苧醇半縮甲醛。

可以存在於可根據本發明使用的種子敷料調配物中的合適第二種稠化劑包括在農藥組成物中用於此目的之全部物質。較宜是纖維素衍生物、丙烯酸衍生物、黃原膠、修飾的黏土、及高分散的矽膠。

可以存在於可根據本發明使用的種子敷料調配物中的合適黏著劑包括可以在種子敷料中使用的全部慣用黏著劑。例如聚乙烯吡咯酮、聚醋酸乙烯酯、聚乙烯醇及纖維基醋酸鈉。

可以存在於可根據本發明使用的種子敷料調配物中的較佳赤黴素是赤黴素A1、A3 (=赤黴酸)、A4及A7；特別

較宜使用赤黴酸。赤黴素是已知(見Wegler “Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel”, Vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412)。

5 可根據本發明使用的種子敷料調配物可以直接或用水稀釋後用於處理非常廣泛種類之任何種子，包括基因轉移植物之種子。關於此點，與經由表達所形成的物質之相互作用也可產生協乘效應。

10 使用可根據本發明使用的種子敷料調配物或經由加入水從其製備的製劑處理種子之合適混合設備包括常用於敷料之全部混合設備。包敷時採用的特定步驟包括將種子放入混合機內，加入特定需求量的種子敷料調配物，不論是其本身或隨後用水稀釋，且進行混合直到均勻分布在種子上。隨意地，然後進行乾燥操作。

15 先前已經提過，根據本發明可以處理全部的植物及其部分。在一個較佳具體實施例中，是處理野生植物物種及植物栽培品系、或經由傳統生物培育方法例如雜交或原生質體融合所得者、及其部分。在另一個較佳具體實施例中，是處理經由基因工程法，如果適當時結合傳統方法(基因修飾有機體)所得的基因轉移植物及植物栽培品系、及其部分。「部分」、「植物的部分」及「植物部分」已經
20 在上文中解釋。

根據本發明特別較宜處理在各情形下商業化供應或使用中的植物栽培品系之植物。植物栽培品系係指經由傳統培育、經由誘變或經由再重組的DNA技術所得的具有獨

特性質(「特徵」)之植物。這些可以是栽培品系、生物-或基因型。

取決於植物種類或植物栽培品系、其位置及生長條件(土壤、氣候、生長期、食物)，根據本發明的處理也可導致超加成(「協乘」)效應。據此，例如降低施加率及/或擴大活性及/或增加可根據本發明使用的物質及組成物之活性、較佳的植物生長、增加高或低溫的耐受性、增加乾旱或水或土壤鹽含量之耐受性、增加開花行為、更容易收成、加速成熟、較高的收成率、較高的品質及/或收成的產物有較高的營養價值、較佳的儲存安定性及/或收成的產物之加工性，超越實際預期的效應。

較宜根據本發明處理的基因轉移植物或植物栽培品系(經由基因工程獲得)包括全部的植物，其因為經由基因修飾，賦予這些植物特定有利、有用的特徵之基因物質。此特徵之實例包括較佳的植物生長、增加高或低溫的耐受性、增加乾旱或水或土壤鹽含量之耐受性、增加開花行為、更容易收成、加速成熟、較高的收成率、較高的品質及/或收成的產物有較高的營養價值、較佳的儲存安定性及/或收成的產物之加工性。此特徵之進一步且特別強調的實例是植物對抗動物及微生物害蟲有較佳的防禦力，例如對抗昆蟲、蠕、植物病原體的真菌；細菌及/或病毒，以及增加植物對某些除草活性化合物之耐受性。可以舉例的基因轉移植物之實例是重要的農作物，例如穀類(小麥、米)、玉米、大豆、馬鈴薯、甜菜、番茄、豌豆及其他蔬菜、棉

花、煙草、油料種子葡萄以及水果植物(蘋果、梨、柑橘及葡萄)，且特別強調的是玉米、大豆、馬鈴薯、棉花、煙草及油料種子葡萄。特別強調的特徵是藉由在植物內形成的毒素增加植物對昆蟲、蜘蛛綱的節肢動物、線蟲及蛭
5 蟪與蝸牛之防禦性，特別是經由基因物質從蘇雲金芽孢桿菌(例如經由基因CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb及CryIF及其組合)在植物內所形成者(以下稱為「Bt植物」)。也特別強調的特徵是藉由內吸性殺蟲劑獲取的抵抗性(SAR)、
10 系統素(systemin)、植物抗毒素、誘發體(elicitors)及抵抗基因與對應表達的蛋白質及毒素，增加植物對真菌、細菌及病毒之防禦力。更特別強調的特徵是增加植物對某些除草活性化化合物之耐受性，例如咪唑啉酮、磺胺脲、嘉磷塞或磷素(phosphinotricin)(例如「PAT」基因)。賦予所要的特徵之基因也可以結合其他基因而存在於基因轉移植物
15 中。可以舉例的「Bt植物」之實例是玉米變種、棉花變種、大豆變種及馬鈴薯變種其係以商標名稱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[®]
20 (馬鈴薯)販售。可以舉例的耐除草劑的植物之實例是玉米變種、棉花變種、大豆變種及馬鈴薯變種其係以商標名稱Roundup Ready[®](耐受嘉磷塞，例如玉米、棉花、大豆)、Liberty Link[®](耐受磷素，例如油料種子葡萄)、IMI[®](耐受咪唑啉酮)及STS[®](耐受磺胺脲，例如玉米)販售。可以

舉例的耐除草劑的植物(在傳統方式培育對除草劑耐受的植物)包括在商標名稱Clearfield® (例如玉米)販售的變種。當然，這些說明也適用於具有這些基因特徵的植物栽培品系或仍待研發的基因特徵且該植物栽培品系在未來將會研發及/或上市。

名單中的植物可以在特別有利的方式下用根據本發明的通式(I)化合物及/或活性化合物混合物根據本發明處理。上述對於活性化合物或混合物之較佳範圍也適用於處理這些植物。特別強調的是用在本文中具體提到的化合物或混合物處理植物。

根據本發明的活性化合物不只作用於對抗植物、衛生及儲存的產品害蟲，也可以在獸醫藥物中使用對抗動物寄生蟲(體外-及體內寄生蟲)，例如硬蜱、軟蜱、蟎、葉蟎、蒼蠅(螫及舔)、寄生的蒼蠅幼蟲、蝨、髮蝨、羽蝨及跳蚤。這些害蟲包括：

從虱目例如血虱科、長顎虱科、虱科、陰虱科、Solenopotes科。

從食毛目及Amblycerina與Ischnocerina亞目例如Trimenopon科、雞虱科、Trinoton科、Bovicola科、Werneckiella科、Lepikentron科、Damalina科、齒毛虱科、Felicola科。

從雙翅目及長角與Brachycerina亞目例如伊蚊科、按蚊科、庫蚊科、蚋科、真蚋科、白蛉科、羅蛉科、庫蠓科、斑虻科、瘤虻科、黃虻科、原虻科、麻虻科、Philipomyia

科、Braula科、家蠅科、齒股蠅科、螫蠅科、血蠅科、Morellia科、廁蠅科、舌蠅科、麗蠅科、綠蠅科、金蠅科、Wohlfahrtia科、麻蠅科、狂蠅科、皮蠅科、胃蠅科、虱蠅科、Lipoptena科、蜉蠅科。

5 從蚤目例如蚤科、櫛頭蚤科、客蚤科、角葉蚤科。

從異翅目例如臭蟲科、錐鼻科、紅獵春科、Panstrongylus科。

從蟻目例如螳螂、美洲大蟻、德國小蟻、Supella科。

10 從蟎亞綱及後氣孔目與中胸氣孔目例如銳緣蜉科、鈍緣蜉科、耳蜉科、硬蜉科、鈍眼蜉科、牛蜉科、革蜉科、血蜉科、璃眼蜉科、扇頭蜉科、皮刺科、耳蟎科、肺刺蟎科、Sternostoma科、瓦蟎科。

15 從前氣門亞目及無氣門亞目例如蟎科、Cheyletiella科、禽螯蟎科、肉蟎科、生疥蟎科、蠕蟎科、恙蟎科、Listrophorus科、粉蟎科、食酪蟎科、Caloglyphus科、Hypodectes科、Pterolichus科、庠蟎科、皮蟎科、耳蟎科、疥蟎科、Notoedres科、Knemidocoptes科、Cytodites科、雞雛蟎科。

20 根據本發明之式(I)活性化合物也適於對抗農業上生產性家畜所感染的節肢動物，這些家畜例如牛、綿羊、山羊、馬、豬、驢、駱駝、水牛、兔子、雞、火雞、鴨子、鵝及蜜蜂，及其他寵物例如狗、貓、籠中鳥及水族箱中的魚，以及所謂的測試動物例如大田鼠、天竺鼠、大鼠與小鼠，經由對抗這些節肢動物，可減少死亡及產量(例如肉

、奶、毛、獸皮、蛋、蜂蜜等)降低之情形，所以使用根據本發明之活性化合物，可以更經濟及更簡單地養殖動物。

根據本發明之活性化合物在獸醫及畜牧方面是以已知方法使用，例如以片劑、膠囊、飲劑、獸用頓服劑、顆粒劑、糊劑、大丸粒、餵食過程及栓劑之形式經由腸道用藥，經由非經腸道用藥例如以注射法(肌內、皮下、靜脈內、腹膜內等)、植入法、經由鼻子用藥、以例如浸漬或洗澡、噴灑、沖淋及打點、清洗及灑粉形式經由皮膚用藥，以及也可經由含活性化合物的塑造物品例如頸圈、耳標、尾標、肢足繃帶、韁繩、印記物品等。

當用在牛、家禽及寵物等畜牧時，本發明活性化合物或組成物能作為適當配製物使用(例如粉劑、乳液、自由流動之組成物)。通常合適的配製物包含活性化合物的範圍從0.1至80重量%，較佳從1至60重量%，更佳從5至30重量%。配製物可直接施用或稀釋成100至10000倍後使用。活性化合物或組成物亦可作為化學浴使用。

另外還發現根據本發明之活性化合物組合物，對於破壞工業用材料的昆蟲，可顯現高度的殺蟲性。

下列昆蟲為可列舉但並不僅限於此之較佳實例：

甲蟲類，例如：家天牛、*Chlorophorus pilosis*、家具竊蠹、*Xestobium rufovillosum*、*Ptilinus prcticornis*、*Dendrobium pertinex*、*Ernobius mollis*、*Priobium carpini*、歐洲竹粉蠹、*Lyctus africanus*、平頸粉蠹、*Lyctus linearis*

、*Lyctus pubescens*、*Trogoxylon aequale*、*Minthes rugicollis*、*Xyleborus spec.*、*Tryptodendron spec.*、*Apate monachus*、*Bostrychus capucins*、*Heterobostrychus brunneus*、*Sinoxylon spec.*及竹長蠹；

5 膜翅類，例如：鋼青小樹蜂、大樹蜂、*Urocerus gigas taignus*及*Urocerus augur*；

白蟻類，例如：*Kaloterms flavicollis*、*Cryptoterms brevis*、*Heteroterms indicola*、黃胸散白蟻、*Reticulitermes santonensis*、*Reticulitermes lucifugus*、澳洲白蟻、*Zootermopsis nevadensis*及台灣家白蟻；

蠹蟲類，例如：西洋衣魚。

在本案中所指的工業材料為非活性物質，舉例來說較宜為塑膠、黏著劑、膠水、紙及卡片、皮革、木材及木材加工產品與塗料組成物。

15 即可使用的組成物如果適當時可含其他殺蟲劑，如果適當時，可含一或多種殺真菌劑。

根據本發明之化合物也可用於保護與海水或鹽水接觸之物品防止附著物，例如船殼、屏、網、建築物、碼頭及訊號設備。

20 而且，根據本發明之化合物單獨或結合其他活性化合物，可以作文抗附著劑使用。

在家裡、衛生及儲存物品保護中，本活性化合物也合適用於控制動物害蟲，尤其是在密閉房間例如公寓、廠房、辦公室、車艙等內部的昆蟲、蜘蛛綱節肢動物及蟎類。

其可獨自使用或結合在家庭殺蟲產品中用於防治這些害蟲之其他活性化合物及佐劑。其對於一般敏感與抗藥物種及全部發育階段具有活性，這些害蟲包括：

從長翅目例如 *Buthus occitanus*。

5 從蜱蟎目例如波斯隱喙蜱、*Argas reflexus*、苔蟎、雞皮刺蟎、*Glyciphagus domesticus*、*Ornithodoros moubat*、血紅扇頭蜱、*Trombicula alfreddugesi*、*Neutrombicula autumnalis*、歐洲家刺皮蟎、美洲家刺皮蟎。

從蛛形目例如 *Aviculariidae*、*Araneidae*。

10 從盲蛛目例如 *Pseudoscorpiones chelifer*、*Pseudoscorpiones cheiridium*、*Opiliones phalangium*。

從等足目例如 *Oniscus asellus*、*Porcellio scaber*。

從倍足亞目例如 *Blaniulus guttulatus*、*Polydesmus* spp.

。

15 從唇足亞目例如 *Geophilus* spp.。

從纓尾目例如 *Ctenolepisma* spp.、西洋衣魚、*Lepismodes inquilinus*。

從蜚蠊目例如東方蜚蠊、德國蜚蠊、*Blattella asahinai*、馬得拉蜚蠊、角腹蠊、*Parcoblatta* spp.、澳洲大蠊、美洲大蠊、褐色大蠊、煙色大蠊、長鬚蜚蠊。

20

從彈尾目例如家蟋蟀。

從革翅目例如歐洲球蝨。

從等翅目例如木白蟻、白蟻。

從嚙蟲目例如 *Lepinatus* spp.、家書虱。

從鞘翅目例如 *Anthrenus* spp.、黑皮蠹、皮蠹、長頭谷盜、郭公蟲、蛛甲、*Rhizopertha dominica*、谷象、米象、玉米象、藥材盜谷。

5 從雙翅目例如 *Aedes* spp.、*Aedes albopictus*、*Aedes taeniorhynchus*、斑按蚊、紅頭麗蠅、*Chrysozona pluvialis*、五帶淡色庫蚊、尖音庫蚊、*Culex tarsalis*、果蠅、黃腹廢蠅、家蠅、*Phlebotomus* spp.、*Sarcophaga carnaria*、*Simulium* spp.、廢螫蠅、歐洲大蚊。

10 從鱗翅目例如小蠟螟、大蠟螟、印度谷螟、*Tinea cloacella*、網衣蛾、袋衣蛾。

從蚤目例如狗櫛頭蚤、貓櫛頭蚤、人蚤、穿皮潛蚤、東方鼠蚤。

從膜翅目例如賓州大黑蟻、黑草蟻、普通黑蟻、*Lasius umbratus*、廚蟻、*Paravespula* spp.、鋪道蟻。

15 從虱目例如頭虱、*Pediculus humanus corporis*、*Phthirus pubis*。

● 從異翅目例如 *Cimex hemipterus*、臭蟲、*Rhodnius prolixus*、*Triatoma infestans*。

20 在家用殺蟲劑領域中，其係獨自使用或結合其他合適的活性化合物例如磷酸酯類、胺基甲酸鹽類、合成除蟲菊酯類、生長調節劑或從其他已知種類的殺蟲劑之活性化合物。

使用時是以氣溶膠、未經加壓的噴霧例如泵及噴霧器噴霧、噴霧器、霧化器、泡沫、膠、蒸發器產物及油纖維

素或塑膠製成之蒸發器片劑、液體蒸發器、膠及膜蒸發器、螺旋槳操作之蒸發器、無動力或被動式蒸發器系統、蛾紙、蛾小藥囊及蛾膠、顆粒或粉粒、用於散播的餌或餌駐點之形式進行。

下面實例是用於說明本發明但是不能作為其限制。在下面實例中使用的溶劑系統是特別較宜。

【實施方式】

實例 1

製備在結晶修飾 I 之式(I)化合物

加入4滴蒸餾水後，將120毫克在結晶修飾II之式(I)化合物(4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](甲基)胺基}呋喃-2(5H)-酮，已知自EP-A 0 539 588；穩定修飾)在攪拌下溫熱至80°C並在此溫度再攪拌約3小時。將樣本放在未加熱的區隔中過夜。如此得到在結晶修飾I之式(I)化合物(穩定修飾)。

實例 1.1

在稀釋劑存在下製備在結晶修飾 I 之式(I)化合物

在攪拌下，將200克在結晶修飾II之式(I)化合物(4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](甲基)胺基}呋喃-2(5H)-酮，已知自EP-A 0 539 588；穩定修飾)與400毫升醋酸丁酯沸騰並在迴流溫度(120°C)再攪拌1小時。然後將加熱關掉，使混合物在攪拌下冷卻，並在約100°C加入少量在結晶修飾I之式(I)化合物(穩定修飾；見實例1)。

到達室溫後，將混合物吸氣過濾，將產物用250毫升石油醚清洗並將殘留物在45°C的真空乾燥箱內乾燥。

如此得到189.1克的固體(HPLC 98.0%)其含90-95%在結晶修飾I之式(I)化合物(穩定修飾)及5-10%在結晶修飾II之式(I)化合物(穩定修飾)。

實例 1.2

在無稀釋劑下製備在結晶修飾 I 之式(I)化合物

在油浴中，將4.5克在結晶修飾II之式(I)化合物(4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](甲基)胺基}呋喃-2(5H)-酮，已知自EP-A 0 539 588；穩定修飾)在125°C熔化並冷卻至105°C，加入種晶(在結晶修飾I之式(I)化合物；穩定修飾；見實例1)並將熔化物冷卻至室溫。

如此得到4.4克的晶體；85-90%在結晶修飾I之式(I)化合物(穩定修飾)，10-15%在結晶修飾II之式(I)化合物(穩定修飾)。

實例 2

製備懸浮液濃縮物

製備懸浮液濃縮物時，首先將全部液體成份混合。在下一個步驟中，加入固體並將混合物攪拌至形成均勻的懸浮液。然後將此均勻的懸浮液先進型粗碾磨後進行細碾磨，使所得的懸浮液其中90%固體粒子之粒子大小是小於10微米。碾磨時，重要的是將研磨機中的壓力保持固定且溫

度不超過40℃以避免碾磨時膠住。在室溫，攪拌並加入 Kelzan® S及水。如此得到均勻的懸浮液濃縮物。

實例 2.1

製備結晶修飾 I 之懸浮液濃縮物

製備式(I)化合物的結晶修飾I之懸浮液濃縮物時，根據上述處理

43.3 克 式(I)化合物的結晶修飾 I (>95%)
8.0 克 Soprophor TS 29
2.0 克 Atlox 4913
20 克 甘油
0.8 克 Kelzan S
0.16 克 Preventol D7
0.240 克 Proxel GXL
0.2 克 Silicon Antischaumemulsion SRE 及
145.3 克 水。

實例 2.2

製備結晶修飾 II 之懸浮液濃縮物/比較調配物

製備式(I)化合物的結晶修飾II之懸浮液濃縮物時，根據上述處理

43.6 克 式(I)化合物的結晶修飾 II (>95%)
8.0 克 Soprophor TS 29
2.0 克 Atlox 4913

20 克 甘油
 0.8 克 Kelzan S
 0.16 克 Preventol D7
 0.240 克 Proxel GXL
 5 0.2 克 Silicon Antischaumemulsion SRE 及
 145.0 克 水。

實例 2.3

製備結晶修飾 I 之油基質的懸浮液濃縮物(OD)

10 在 100 克活性化合物/升(OD 100 調配物)之濃度製備式
 (I)化合物的結晶修飾 I 之油基質的懸浮液濃縮物(OD)時，
 在室溫及攪拌下將

298 克 式(I)化合物的結晶修飾 I (>85%)

295 克 Arlaton T(V)

15 132.8 克 Atlox 4894

14.7 克 Morwet D 425

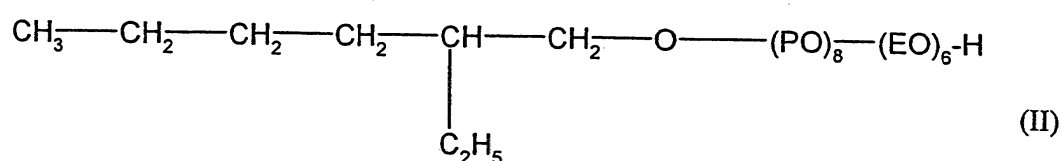
1.5 克 Silfoam SC 1132

5.9 克 無水檸檬酸

5.9 克 Vulkanox BHT

20 添加至

590 克 式(II)化合物



其中

EO 代表 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-$ ，

PO 代表 $\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---O---} \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array}$ 且

數字 8 及 6 是平均值，及
1606 克 葵花油之混合物中。

完成添加後，將混合物在室溫再攪拌 10 分鐘。將所得的均勻懸浮液先進型粗碾磨後進行細碾磨，使所得的懸浮液其中 90% 固體粒子之粒子大小是小於 6 微米。

根據本發明的組成物之成份，以其商標名稱定義，可以得自下面的來源：

商標名稱	來源
Arlaton T(V)	Uniqema
Atlox 4913	Uniqema
Atlox 4894	Uniqema
Kelzan S	CP Kelco
Morwet D 425	Akzo Nobel
Preventol D7	Bayer AG
Proxel GXL	Bayer AG
Silfoam SC 1132	Wacker Silicones
Silicon Antischaumemulsion SRE	Wacker Silicones
Soprophor TS 29	Rhodia

Vulkanox BHT	Bayer AG
--------------	----------

實例 3

製劑性質

使用標準的設定，在從Getzmann GmbH的Dispermat[®] SL上製備實例2.1之調配物；玻璃珠的大小是0.75至1.0毫米，填充度80%，每秒4000轉，處理量0.3升/小時，研磨機中的最高溫度36°C在壓力<0.01巴。

當實例2.2之調配物是在Dispermat[®] SL上製備時，處理量必須下降至0.1升/小時以避免碾磨時膠住。由於強烈的溫度上升及壓力增加，不可能在沒有降低處理量下製備實例2.2之調配物。

實例 4

儲存性質

將實例2.1及2.2之調配物在54°C儲存8週。儲存後，使樣本恢復到室溫，並將儲存的調配物之性質與根據實例2新製備的樣本比較。

實例2.1之調配物顯示輕微的相分離但是很容易再度分散。調配物的性質在儲存後沒有改變。

實例2.2之比較調配物顯示輕微的相分離，其在強烈搖動後再度分散。同時觀察到晶體成長及個別粒子之強烈聚集。一小時內，從此調配物製備的1%強度噴霧水溶液形成沈澱，因此很難應用。

生物實例

式(I)化合物之結晶修飾I對抗傷害植物的昆蟲/室外試驗稻米菲律賓之作用

5 稻褐飛虱試驗(葉子施加)

為了製備活性化合物之合適製劑，將根據實例2.3 (OD 100調配物)之油基質的懸浮液濃縮物用水稀釋至所要的濃度。經所需的時間後，測定殺死%。100%表示全部的葉跳蟬都被殺死；0%表示沒有葉跳蟬被殺死。

10 在此測試中，在結晶修飾I的式(I)化合物顯示良好的活性。

活性化合物濃度克/公頃	200
-------------	-----

經 14 天後的殺死%	100
-------------	-----

15 **【圖式簡單說明】**

圖1：式(I)化合物的結晶修飾I之X-光粉末繞射圖。

圖2：式(I)化合物的結晶修飾II之X-光粉末繞射圖。

圖3：式(I)化合物的結晶修飾I之IR光譜。

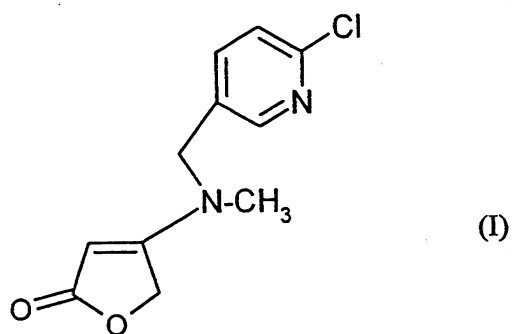
圖4：式(I)化合物的結晶修飾II之IR光譜。

20 圖5：式(I)化合物的結晶修飾I之拉曼光譜。

圖6：式(I)化合物的結晶修飾II之拉曼光譜。

五、中文發明摘要：

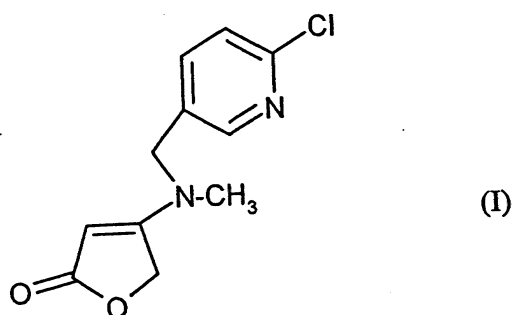
本發明係關於式(I)化合物之定義的結晶修飾，其製法及其在農藥製劑中的用途。



10

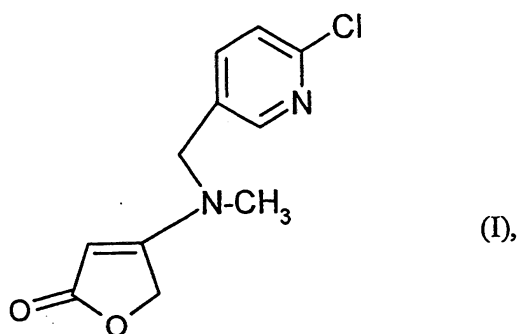
六、英文發明摘要：

The present invention relates to a defined crystalline modification of the compound of the formula (1), to processes for its preparation and to its use in agrochemical preparations.



十、申請專利範圍：

1. 一種式(I)化合物之結晶修飾 I



其特徵在於當使用 Cu K α 照射時，其 x-光粉末繞射圖具有以下反射平面

2 θ /°
16.80
19.58
21.11
21.32
23.23
28.00

2. 根據申請專利範圍第 1 項之結晶修飾 I，其特徵在於當使用 Cu K α 照射時，其 x-光粉末繞射圖具有以下反射平面

2 θ /°
16.80
19.58
21.11

21.32
22.92
23.23
23.97
28.00

3. 一種組成物，其含有根據申請專利範圍第 1 及 2 項中一或多項之式(I)化合物之結晶修飾 I 及合適的佐劑。
4. 一種組成物，其含有根據申請專利範圍第 1 及 2 項中一或多項之式(I)化合物之結晶修飾 I 及式(I)化合物之結晶修飾 II 及合適的佐劑，其特徵在於該組成物含不超過 20 重量%的式(I)化合物之結晶修飾 II。
5. 根據申請專利範圍第 1 及 2 項中一或多項之式(I)化合物之結晶修飾 I 或根據申請專利範圍第 3 或 4 項之組成物用於製備控制害蟲的組成物之用途。
6. 根據申請專利範圍第 1 及 2 項中一或多項之式(I)化合物之結晶修飾 I 或根據申請專利範圍第 3 或 4 項之組成物用於控制植物害蟲之用途。
7. 根據申請專利範圍第 1 及 2 項中一或多項之式(I)化合物之結晶修飾 I 或根據申請專利範圍第 3 或 4 項之組成物用於控制動物寄生蟲之用途。
8. 根據申請專利範圍第 1 及 2 項中一或多項之式(I)化合物之結晶修飾 I 或根據申請專利範圍第 3 或 4 項之組成物用於控制破壞工業物料的昆蟲之用途。
9. 根據申請專利範圍第 1 及 2 項中一或多項之式(I)化合物

之結晶修飾 I 或根據申請專利範圍第 3 或 4 項之組成物
用於處理種子之用途。

- 5 10. 一種用於控制不欲的昆蟲之方法，其特徵在於將含根據
申請專利範圍第 1 及 2 項中一或多項之式(I)化合物之結
晶修飾 I 或根據申請專利範圍第 3 或 4 項之組成物施用
至昆蟲及/或其處所及/或種子。

十一、圖式：

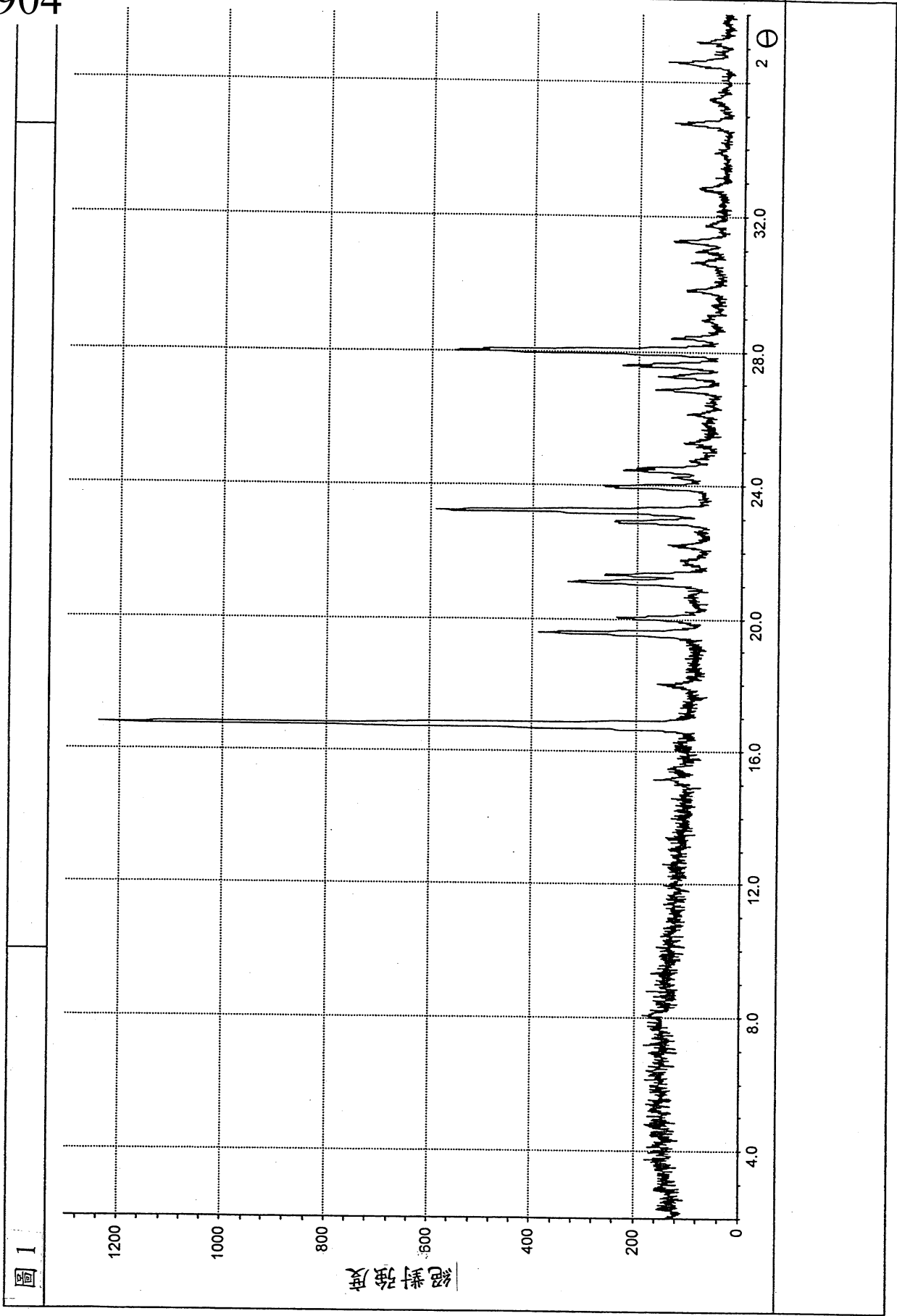
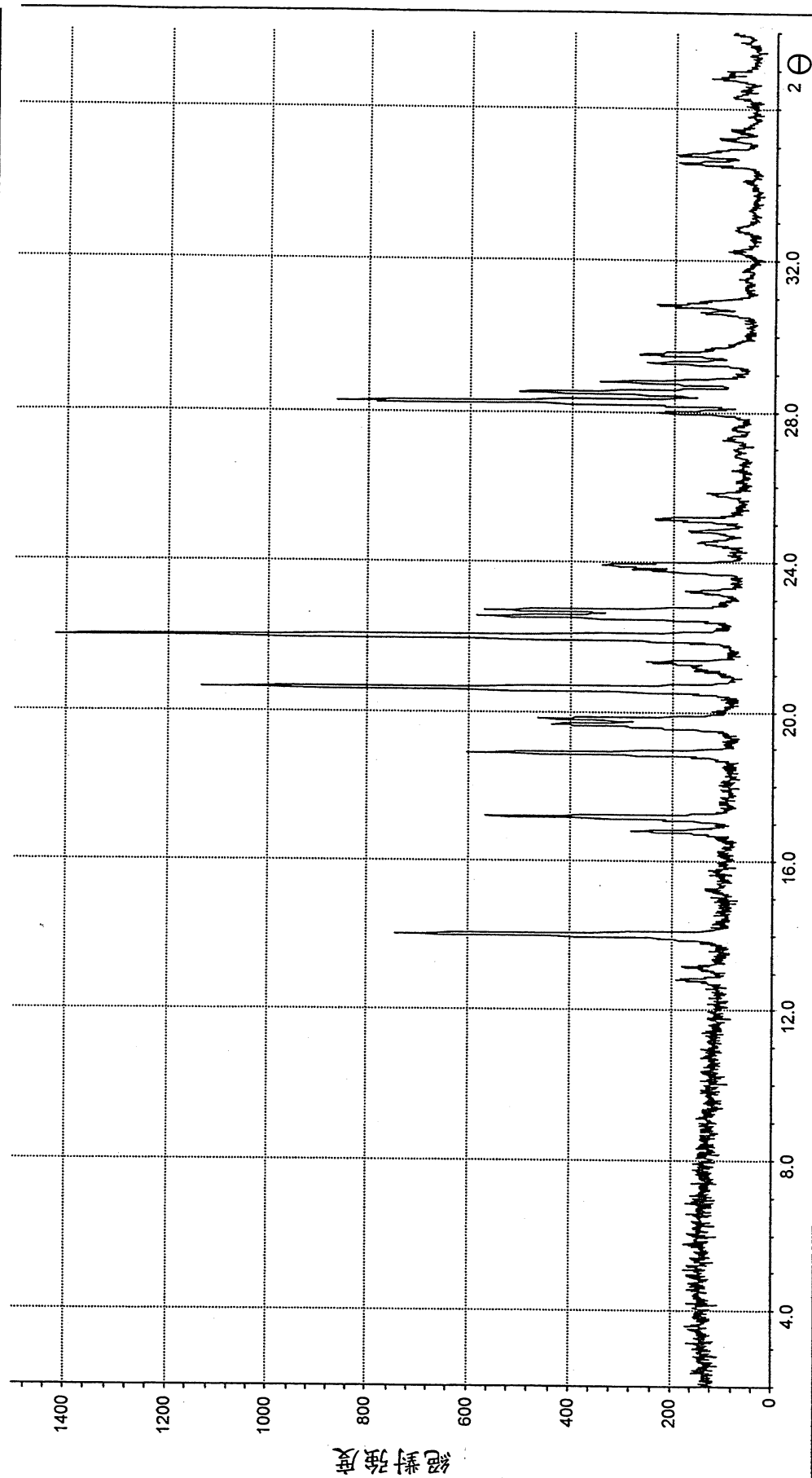


圖 2



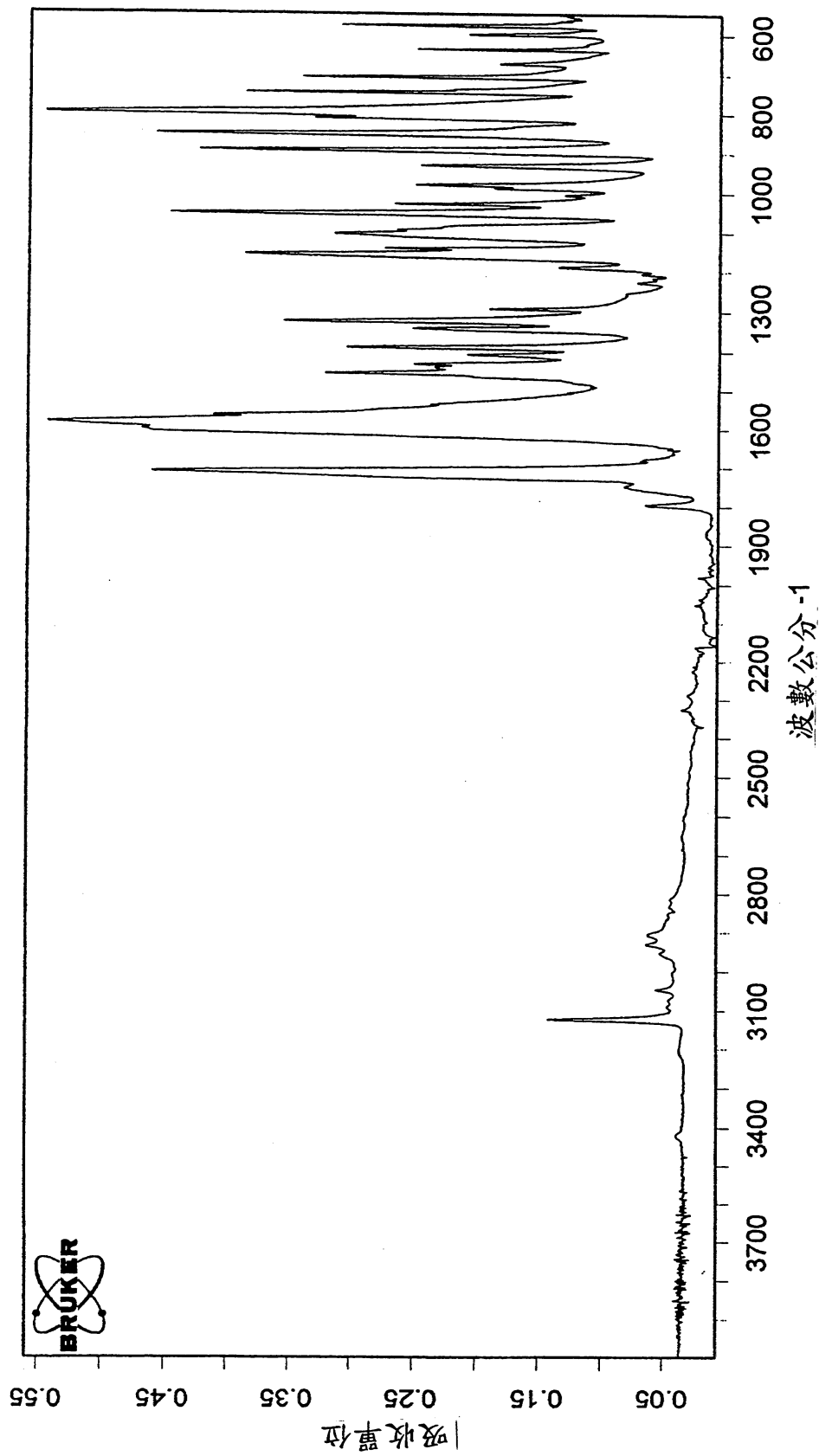


圖 3

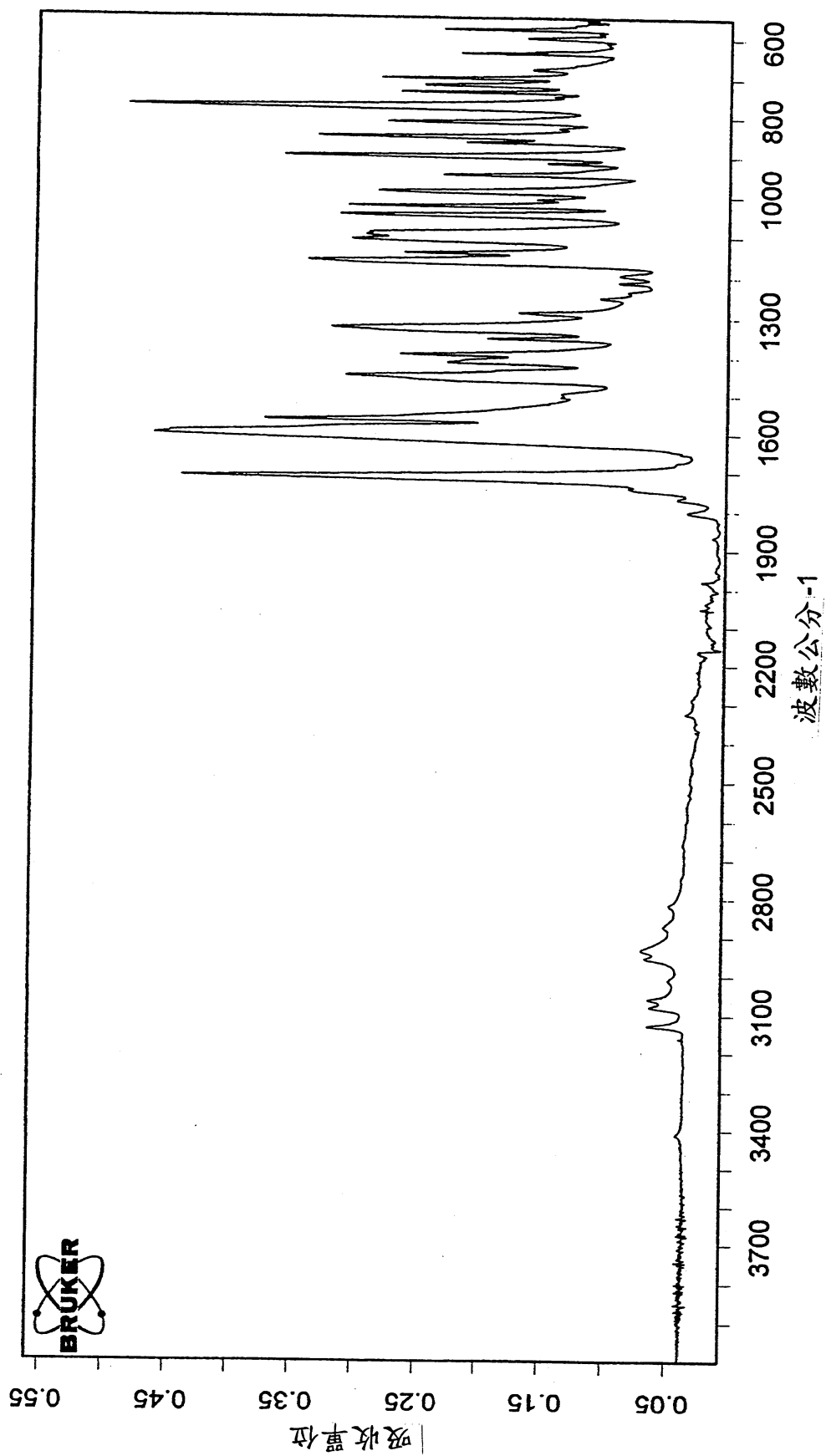


圖 4

圖 5

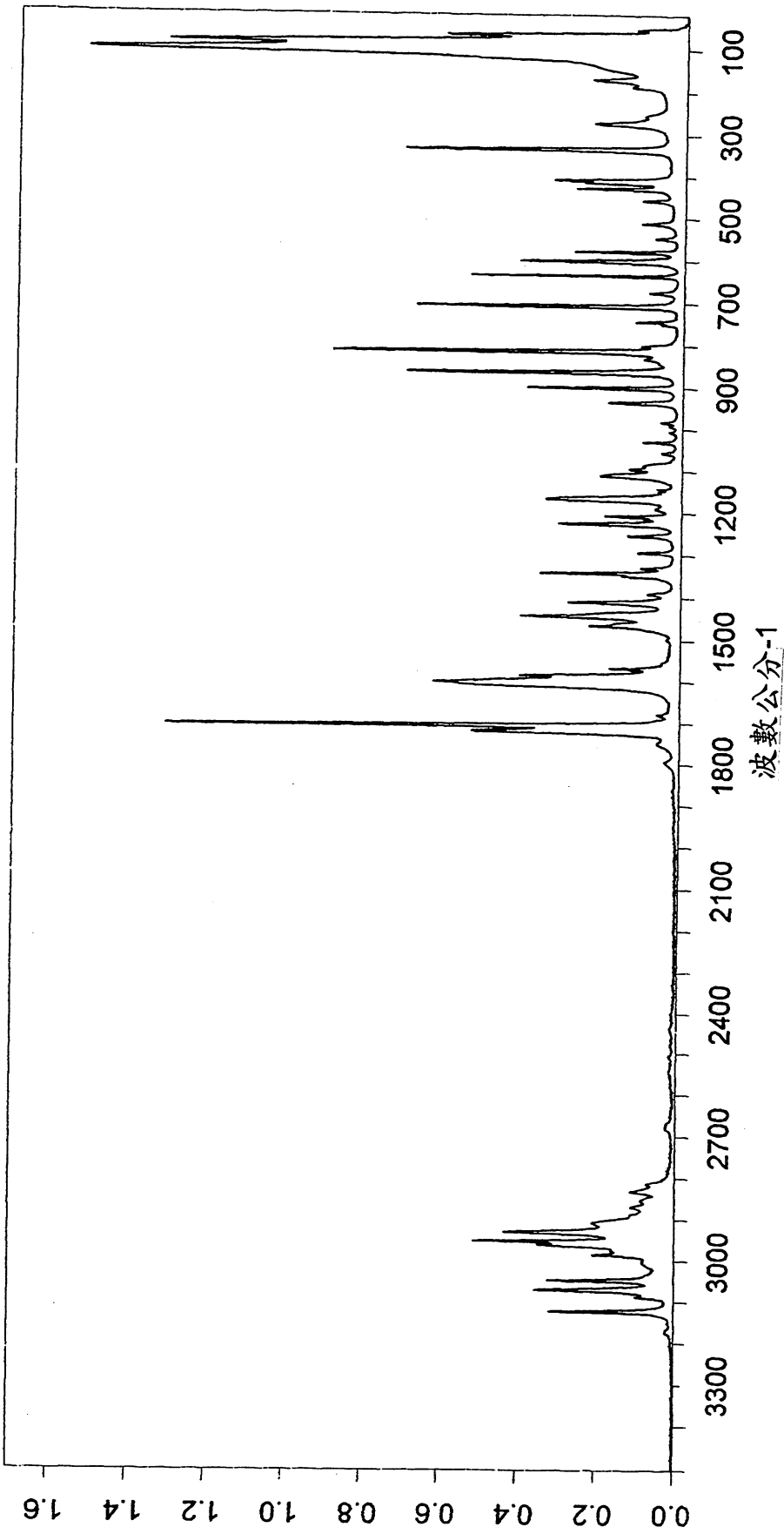
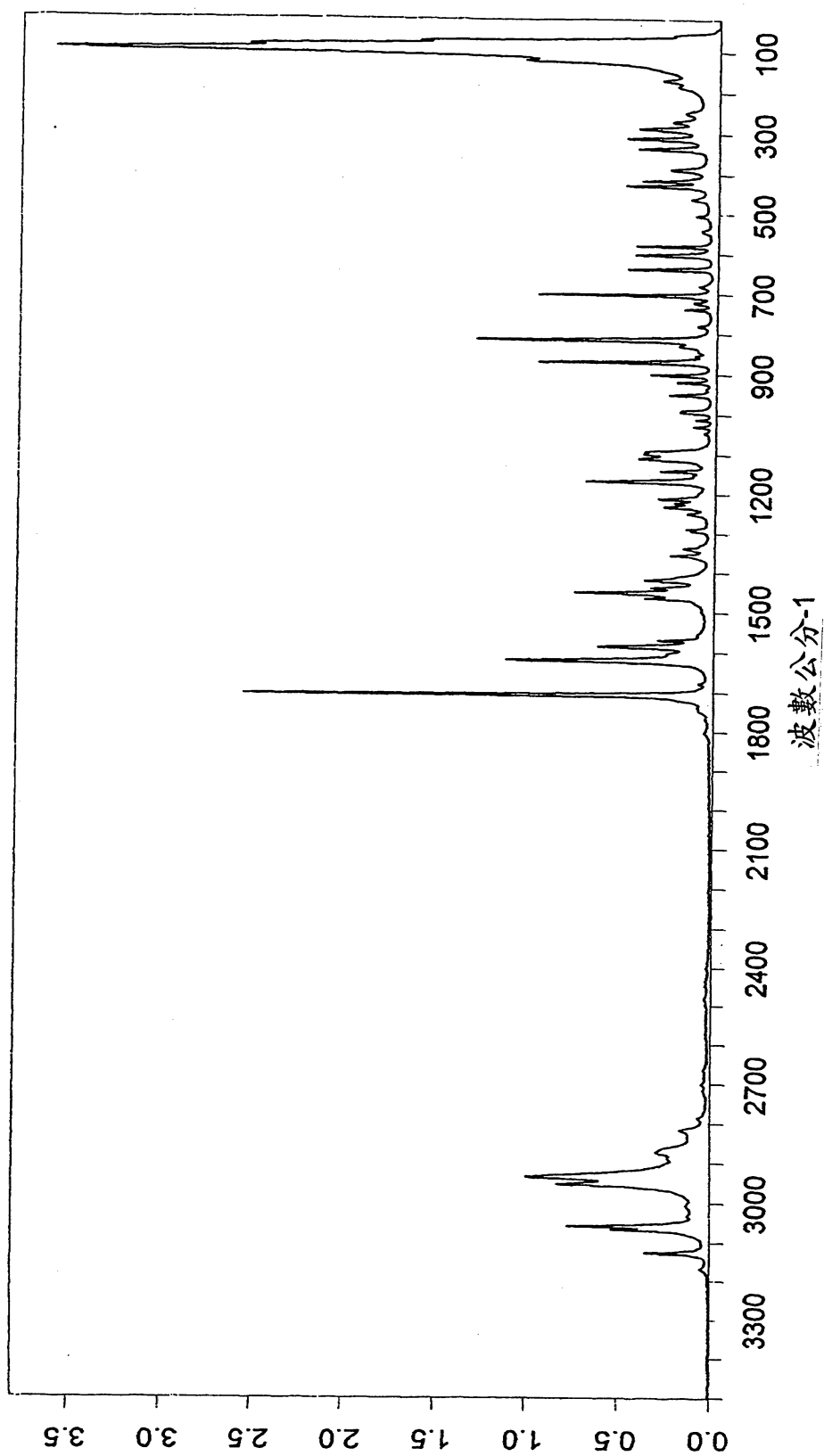


圖 6



七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第 (1) 圖。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

無。

5

10

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

