

306916

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大類：
IPC分類：

A6
B6

本案已向：

瑞士 國(地區) 申請專利，申請日期：1994.09.13 案號：2783/94-4，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(I)

本發明相關於式 I 之新穎殺害蟲化合物



其中：

R_1 與 R_2 彼此獨立為 $C_1 - C_6$ 烷基，含有 1 至 5 個鹵原子之鹵 - $C_1 - C_6$ 烷基， $C_1 - C_2$ 烷氧基 - $C_1 - C_6$ 烷基，硝基 - $C_1 - C_6$ 烷基，氰基 - $C_1 - C_6$ 烷基， $C_1 - C_2$ 烷鹽基 - $C_1 - C_6$ 烷基， $C_1 - C_2$ 烷氧基羰基 - $C_1 - C_6$ 烷基， $C_1 - C_2$ 烷基硫 - $C_1 - C_6$ 烷基， $C_1 - C_2$ 烷亞磺鹽基 - $C_1 - C_6$ 烷基， $C_1 - C_2$ 烷磺鹽基 - $C_1 - C_6$ 烷基， $C_2 - C_6$ 烯基，含有 1 至 5 個鹵原子之鹵 - $C_2 - C_6$ 烯基， $C_2 - C_6$ 炔基，含有 1 至 5 個鹵原子之鹵 - $C_2 - C_6$ 炔基， $C_3 - C_7$ 環烷基或鹵素；或

R_1 與 R_2 共同形成一飽和的或未飽和的 5 至 7 員之碳環或雜環，其可包含一或兩個選擇自 O 及 S 之雜原子；

R_3 與 R_4 彼此獨立為氫， $C_1 - C_6$ 烷基或鹵素；

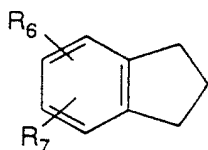
R_5 為氫， $C_1 - C_6$ 烷基，其為未經取代之或經由氫基

五、發明說明 (>)

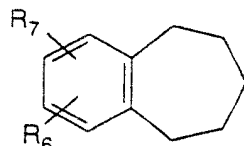
，硝基，鹵素，羧基， $C_1 - C_2$ 烷氧基羰基， $C_1 - C_2$ 烷
 鹽基， $C_1 - C_2$ 烷磺鹽基或苯基磺鹽基， $C_2 - C_6$ 烯基， C
 $2 - C_6$ 炔基或苄基加以取代；

X 為一 $C_1 - C_5$ 鏈，其可包含選擇自 O, S 以及 N 之一或
 兩個雙鍵，一或兩個三鍵以及一或兩個選擇自 O, S 及 N 之雜
 原子雜原子，且其為未經取代之或經由 $C_1 - C_4$ 烷基，含
 有 1 至 5 個鹵原子之鹵 - $C_1 - C_4$ 烷基， $C_2 - C_4$ 烯基，含
 有 1, 2 或 3 個鹵原子之鹵 - $C_2 - C_4$ 烯基， $C_2 - C_4$ 炔基，
 $C_3 - C_7$ 環烷基，羥基或鹵素加以取代；

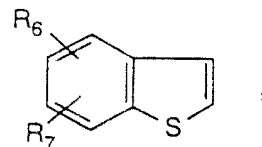
Y 為式 (a) 至 (x) 之一群；



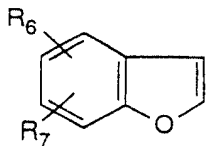
(a)



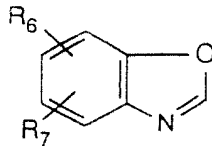
(b)



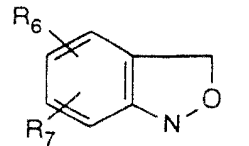
(c)



(d)

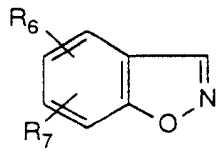


(e)

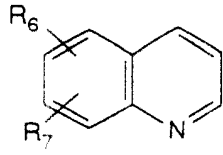


(f)

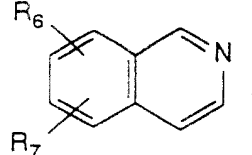
五、發明說明()



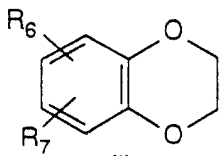
(g)



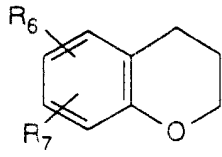
(h)



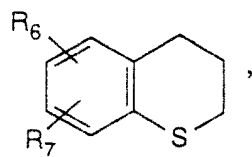
(i)



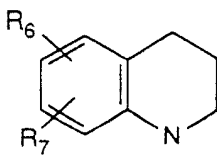
(j)



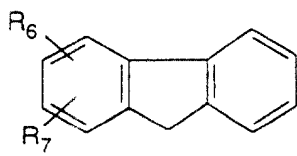
(k)



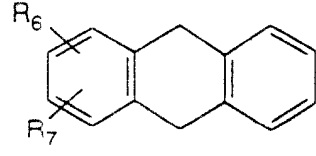
(l)



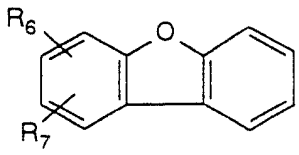
(m)



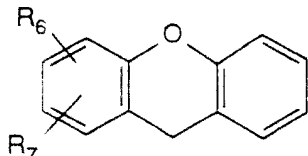
(n)



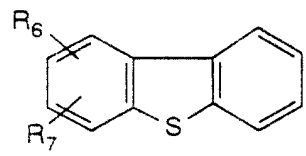
(o)



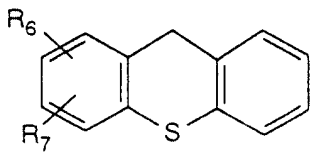
(p)



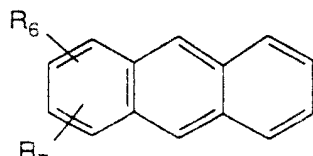
(q)



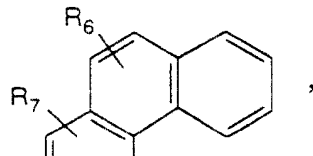
(r)



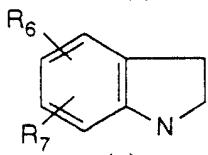
(s)



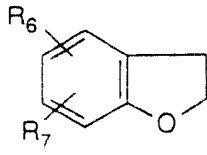
(t)



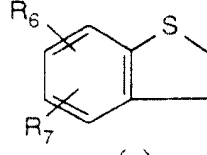
(u)



(v)



(w)



(x)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

本

訂

號

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明(4)

R_6 與 R_7 彼此獨立為氫，鹵素， $C_1 - C_6$ 烷基，含有 1 至 5 個鹵原子之鹵素 - $C_1 - C_6$ 烷基， $C_1 - C_2$ 烷氧基 - $C_1 - C_6$ 烷基， $C_1 - C_6$ 烷氧基，含有 1 至 5 個鹵原子之鹵 - $C_1 - C_6$ 烷氧基， $C_1 - C_6$ 烷基硫， $C_1 - C_6$ 烷亞磺鹽基， $C_1 - C_6$ 烷磺鹽基，苯基，苄基，苯氧基，苯基硫，經基，硫氫基，硝基，氰基， $C_1 - C_4$ 烷鹽基，鹵 - $C_1 - C_4$ 烷鹽基或 $C_1 - C_4$ 烷氧基羰基；或，總是得到，其游離形式或鹽形式之異構體。

本發明進一步相關於這些化合物之製備，關於包含至少一種該化合物作為活性成份之農業化學組成物，以及相關於該化合物或組成物用於害蟲控制之用途，偏好作為農業與園藝中之殺微生物劑類，殺昆蟲劑類以及殺蟎劑類。

式 I 之化合物以及其可能的異構體可以鹽形式加以獲得。由於式 I 之化合物包含至少一個鹼中心，其可典型地形成酸加成鹽類。這些鹽類可傳統地以礦物酸例如硫酸，磷酸或氫鹵酸，以有機性羧酸例如乙酸，乙二酸，丙二酸，反丁烯二酸或苯二甲酸，以羧酸例如抗壞血酸，乳酸，酒石酸，或檸檬酸，或以苯甲酸，或以有機性磷酸例如甲烷磺酸或 p- 甲苯磺酸而形成。

五、發明說明 (5)

具有至少一個酸基之式 I 之化合物亦可與鹼類形成鹽類。含有鹼類之合適鹽類為典型地金屬鹽類例如鹼金屬鹽類或鹼土金屬鹽類，如鈉鹽類，鉀鹽類或鎂鹽類，或含有氨或一有機胺例如嗎啉基，吡啶，吡咯啶，單一，二一或三一較低級烷基胺，其典型地為乙基胺，二乙基胺，三乙基胺或二甲基丙基胺，或單一，二一或三經基一較低級烷基胺，如單一，二一或三乙醇胺。相關的內鹽類亦可被形成。農業化學上可接受之鹽類偏好為本發明之範疇內。

當式 I 之化合物包含不對稱碳原子時，則該化合物是以光學活性形式加以獲得。由於雙鍵之存在，該化合物可以 [E] 或 [Z] 形式加以獲得。Atropisomerism 亦可發生。本發明不僅相關於純化的異構物，如對映體與非對映異構物，亦相關於所有可能的異構物之混合物，如非對映異構物之混合物，外消旋物或外消旋物之混合物。

除非另有指示，整篇說明書所使用之一般專有名詞具有下列之意義：

烷基團為，依據碳原子之數目，直鏈或分支的且將典型地為甲基，乙基，n-丙基，異丙基，n-丁基，仲-丁基，異丁基，叔-丁基，n-戊基，叔-戊基，1-己基或 3-己基。

五、發明說明 (b)

烯基將被解釋為意指直鏈或分支的烯基例如烯丙基，甲代烯丙基，1-甲基乙烯基或丁-2-烯-1-基。偏好的烯基自由基包含3至4個碳原子於鏈中。

炔基可同樣地為，依據碳原子之數目，直鏈或分支的且典型地為炔丙基，丁-1-炔-1-基或丁-1-炔-3-基。偏好的意義為炔丙基。

鹵素以及鹵取代基將被解釋為一般意指氟基，氯基，溴基或碘基。氟基，氯基或溴基為偏好的意義。

鹵烷基可包含相同的或相異的鹵原子，典型地氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基，三氟甲基，氯甲基，二氯甲基，三氯甲基，2, 2, 2-三氟乙基，2-氟乙基，2-氯乙基，2, 2, 2-三氯乙基，3, 3, 3-三氟丙基。

烷氧基典型地為甲氧基，乙氧基，丙氧基，異丙氧基，n-丁氧基，異丁氧基，仲-丁氧基以及叔-丁氧基。甲氧基以及乙氧基為偏好的。

鹵烷氧基典型地為二氟甲氧基，三氟甲氧基，2, 2, 2-三氟乙氧基，1, 1, 2, 2-四氟乙氧基，2-氟乙氧基，

五、發明說明 (7)

2-氯乙氧基以及2,2-二氟乙氧基。

環烷基，依據環的大小，為環丙基，環丁基，環戊基，環己基或環庚基。

根據包含於特定例子中之碳原子數目，烷鹽基為直鏈或分支的且典型地為甲鹽基，乙鹽基，丙鹽基，丁鹽基或三甲基乙鹽基。

在本發明之範圍內，偏好的化合物為：

(1) 式 I 之化合物，其中

R_1 與 R_2 彼此獨立為 $C_1 - C_4$ 烷基，含有 1 至 5 個鹵原子之鹵 - $C_1 - C_4$ 烷基， $C_1 - C_2$ 烷氧基 - $C_1 - C_4$ 烷基，硝基 - $C_1 - C_4$ 烷基，氰基 - $C_1 - C_4$ 烷基， $C_1 - C_2$ 烷鹽基 - $C_1 - C_4$ 烷基， $C_1 - C_2$ 烷氧基羰基 - $C_1 - C_4$ 烷基， $C_1 - C_2$ 烷基硫 - $C_1 - C_4$ 烷基， $C_1 - C_2$ 烷亞磺鹽基 - $C_1 - C_4$ 烷基， $C_1 - C_2$ 烷磺鹽基 - $C_1 - C_4$ 烷基， $C_2 - C_4$ 烯基，含有 1, 2 或 3 個鹵原子之鹵 - $C_2 - C_4$ 烯基， $C_2 - C_4$ 炔基，含有 1, 2 或 3 個鹵原子之鹵 - $C_2 - C_4$ 炔基， $C_3 - C_7$ 環烷基或鹵素；或

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

多

五、發明說明(8)

R_1 與 R_2 共同形成一飽和的或未飽和的 6 員碳環或雜環，其可包含一或兩個選擇自 O 及 S 之雜原子；

R_3 與 R_4 彼此獨立為氫， $C_1 - C_4$ 烷基或鹵素；

R_5 為氫， $C_1 - C_4$ 烷基或甲基，其為經由氟基，硝基，鹵素，羧基，甲氧基羰基或苯基磺醯基加以取代；

R_6 與 R_7 彼此獨立為氫，鹵素， $C_1 - C_4$ 烷基，包含 1 至 5 個鹵素原子之鹵 - $C_1 - C_4$ - 烷基， $C_1 - C_4$ 烷氧基，包含 1 至 5 個鹵素原子之鹵 - $C_1 - C_4$ 烷氧基，羥基或 $C_1 - C_4$ 烷醯基；且其中

X 與 Y 具有已賦予的定義。

(2) 在 (1) 中所描述之化合物，那些化合物中：

R_5 為氫， $C_1 - C_6$ 烷基或苄基。

(3) 式 I 之化合物，其中：

R_1 與 R_2 彼此獨立為 $C_1 - C_4$ 烷基，含有 1 至 5 個鹵原子之鹵 - $C_1 - C_4$ 烷基， $C_1 - C_2$ 烷氧基 - $C_1 - C_4$ 烷基

五、發明說明(9)

，硝基 - C₁ - C₄ 烷基，氟基 - C₁ - C₄ 烷基，C₁ - C₂ 烷鹽基 - C₁ - C₄ 烷基，C₁ - C₂ 烷氧基羰基 - C₁ - C₄ 烷基，C₁ - C₂ 烷基硫 - C₁ - C₄ 烷基，C₁ - C₂ 烷亞磺鹽基 - C₁ - C₄ 烷基，C₁ - C₂ 烷磺鹽基 - C₁ - C₄ 烷基，C₂ - C₄ 烯基，含有 1, 2 或 3 個鹵原子之鹵 - C₂ - C₄ 烯基，C₂ - C₄ 炔基，含有 1, 2 或 3 個鹵原子之鹵 - C₂ - C₄ 炔基，C₃ - C₇ 環烷基或鹵素；或

R₁ 與 R₂ 共同形成一飽和的或未飽和的 6 員碳環或雜環，其可包含一或兩個選擇自 O 及 S 之雜原子；

R₃ 與 R₄ 彼此獨立為氫，C₁ - C₄ 烷基或鹵素；

R₅ 為氫或 C₁ - C₄ 烷基；

R₆ 與 R₇ 彼此獨立為氫，鹵素，C₁ - C₄ 烷基，包含 1 至 5 個鹵原子之鹵 - C₁ - C₄ - 烷基，C₁ - C₄ 烷氧基，包含 1 至 5 個鹵原子之鹵 - C₁ - C₄ 烷氧基，羥基或 C₁ - C₄ 烷鹽基；且其中

X 與 Y 具有已賦予的定義。

(4) 在 (3) 中所描述之式 I 化合物，那些化合物中：

五、發明說明(10)

R_1 為 $C_1 - C_4$ 烷基，包含 1 至 5 個鹵原子之鹵 - $C_1 - C_4$ 烷基， $C_1 - C_2$ 烷氧基 - $C_1 - C_4$ 烷基或 $C_3 - C_7$ 環烷基；

R_2 為鹵素；

R_3 以及 R_4 為氫；

R_5 為氫或 $C_1 - C_4$ 烷基；

X 為 $C_1 - C_3$ 鏈，其可包含一雙鍵或三鍵且其為未經取代之或經由 $C_1 - C_4$ 烷基， $C_3 - C_7$ 環烷基，羥基或鹵素加以取代。

(5) 在 (4) 中所描述之式 I 化合物，那些化合物中：

R_1 為 $C_1 - C_4$ 烷基，或 $C_3 - C_7$ 環烷基

R_2 為氯或溴；

R_3 以及 R_4 為氫；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (1 |)

R₅ 為 氫 ；

X 為 下 式 之 基 團 ； - CH₂ - ， - CH (CH₃) - ， - CH₂ CH₂ - ， - CH₂ CH₂ CH₂ - ， - CH₂ (CH (CH₃) - ， - CH (CH₃) CH₂ - ， - CH = CH - ， CH = CH - CH₂ 或 CH₂ - CH = CH - 。

(6) 式 I 之 化 合 物 ， 其 中 ；

Y 為 式 (a) ， (b) ， (n) ， (o) ， (t) ， (u) 之 等 環 基 團 ；

R₆ 與 R₇ 彼 此 獨 立 為 氫 ， 氯 ， 溴 ， C₁ - C₂ 烷 基 ， 包 含 1 至 3 個 鹵 原 子 之 鹵 甲 基 ， C₁ - C₂ 烷 氧 基 ， 包 含 1 至 3 個 鹵 原 子 之 鹵 甲 氧 基 ， 包 含 1 至 4 個 鹵 原 子 之 鹵 乙 氧 基 ， 或 C₁ - C₂ 烷 鹽 基 。

(7) 式 I 之 化 合 物 ， 其 中 ；

Y 為 式 (c) ， (d) ， (f) ， (g) ， (h) ， (i) ， (j) ， (k) ， (l) ， (m) ， (p) ， (q) ， (r) ， (s) ， (v) ， (w) ， (x) 之 雜 環 基 團 ；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表

訂

第

五、發明說明 (12)

R_6 與 R_7 彼此獨立為氫，氯，溴， $C_1 - C_2$ 烷基，包含 1 至 3 個鹵原子之鹵甲基， $C_1 - C_2$ 烷氧基，包含 1 至 3 個鹵原子之鹵甲氧基，包含 1 至 4 個鹵原子之鹵乙氧基，或 $C_1 - C_2$ 烷醯基。

(8) 在 (1) 中所描述之式 I 化合物中，那些化合物中：

Y 為式 (a)，(b)，(c)，(j) 或 (n) 之基團；

R_6 與 R_7 彼此獨立為氫，鹵素或 $C_1 - C_4$ 烷基。

(9) 在 (3) 中所描述之式 I 化合物中，那些化合物中：

X 為式 $-CH_2-$ ， $-CH_2CH_2-$ ， $-CH_2CH_2CH_2-$ 或 $-CH=CH-$ ；

R_6 與 R_7 彼此獨立為氫，鹵素或 $C_1 - C_4$ 烷基。

(10) 在 (9) 中所描述之式 I 化合物，那些化合物中：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

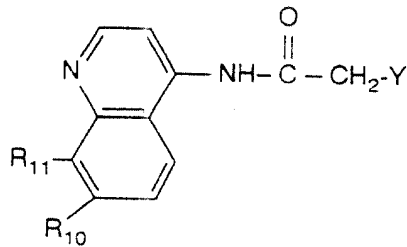
訂

五、發明說明 (1)

R_1 為甲基或乙基；

X 為式 $-\text{CH}_2-$ 之基團。

(11) 式 I·5 之化合物



I.5

其中：

R_{10} 與 R_{11} 彼此獨立為氫，或鹵素；

Y 為式 (a) 至 (x) 之基團；且，在這些化合物中，特別是那些其中

R_{11} 為氫或氫且 R_{10} 為氫，氟或氯。

式 I 之化合物可如下加以製備：

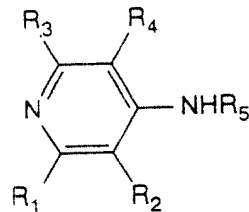
一種式 II 之化合物

五、發明說明(14)



II

或其酸性鹵化物，其中 X 以及 Y 為如式 I 之定義，與式 III 之化合物進行反應

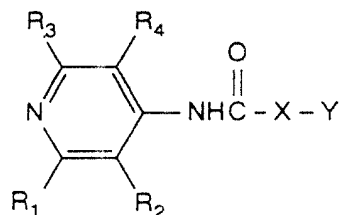


III

其中 R₁ 至 R₅ 具有如式 I 所給予之意義，在合適的縮合劑及 / 或一鹼之缺乏或存在下，以得到式 I 之化合物。

合適的縮合劑類之說明實例為 N, N-二環己基碳化二亞胺，五氯化磷，碳醯氯以及亞硫醯氯。

亦可能製備式 I 之化合物，其中 R₅ 具有所給予之意義，但不為氫，經由使式 Ia 之化合物



Ia

五、發明說明 (15)

其中 R_1 至 R_4 ， X 與 Y 具有如式 I 所給予之意義，與式 IV 之化合物進行反應



其中 R_5 為如式 I 之定義，且 L 為一離去基團，如鹵素，甲苯磺酸，甲基磺酸或三氟甲基磺酸 (triflate)，於一溶劑中，方便地於 DMF，THF，二氧陸環，二甲基乙醯胺，二甲基亞砷，叔-丁基甲基醚中，在一鹼之存在下，如氫化鈉，氫化鉀，叔-丁基鉀，甲基鈉，三乙基胺，吡啶，碳酸鉀。

根據 X 之重要性，式 II 之化合物可如下加以製備：

(1) 式 $Y - CH_2 - COOH$ (II·1) 之化合物，其中 Y 具有如式 I 所給予之意義：

a) 式 $Y - CO - CH_3$ 之化合物與 S /嗎啉基或與聚硫化銨溶液進行反應且接下來進行水解 (Willgerodt 或 Willgerodt-Kindler 反應)。

b) 式 $Y - CO - CH_3$ (Va) 之化合物在 $HClO_4$ 存在下與

五、發明說明 (16)

Tl^3+ 或與 $Tl(NO_3)_3$ 在蒙脫土 K-10 (TTN-K-10 試劑) 上於合適之溶劑中進行反應，如於酒精中，例如甲醇，且接下來進行水解 (J. Med. Chem., Vol22, S. 1068 (1979); Synthesis, 1979, p. 481)。

c) 式 $Y-CHO$ 之化合物與 $(CH_3)_2N-CH[PO(OC_2H_5)_2]_2$ 進行反應且接下來進行水解 (Synth. Comm., Vol. 12, p. 415 (1982))。

d) 式 $Y-CH_2-Hal (Vc)$ 之化合物與 CN^- 進行反應且接下來進行水解。

(2) 式 $Y-CH=CH-COOH (II. 2)$ 之化合物，其中 Y 具有如式 I 所給予之意義，為如下進行製備：

式 $Y-NH_2 (Vd)$ 之化合物與有機性或無機性亞硝酸鹽進行重氮化作用，該重氮基化合物與丙烯酸鹽在 $CuCl$ 存在下進行反應，且產生之化合物接著進行水解 (Meerwein 芳基化作用)。

(3) 式 $Y-CH_2-CH_2-COOH (II)$ 之化合物，其中 Y 具有如式 I 所給予之意義：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (17)

經由式 $Y-CH=CH-COOH$ (II · 2) 之化合物之氫化作用。 [Arzneimittel Forsch · Vol · 30 , p · 454 (1980)] 。

(4) 式 $Y-CH_2-CH_2-CH_2-COOH$ (II · 4) 之化合物，其中 Y 具有如式 I 所給予之意義：

式 $Y-H$ (Ve) 之化合物與丁二酸酐在 $AlCl_3$ 存在下進行芳基化作用以得到式 $Y-CO-CH_2-CH_2-COOH$ (II · 5) 之化合物且接下來與水合肼進行反應 [Arzneimittel Forsch · Vol · 30 , p · 454 (1980)] 。

式 III 之化合物為已知，如得自 J · Med · Chem · 1989 , 32 , 1970 - 77 , 且可經由此中所描述之方法加以製備。

以上所描述之反應是以本質上已知之方式，方便地在缺乏或存在一合適的溶劑或稀釋劑或其混合物下施行，且當需要時，伴隨室溫下冷卻或伴隨加熱，合適於自約 $-20^{\circ}C$ 至反應介質之沸騰溫度之溫度範圍內，偏好自約 $-20^{\circ}C$ 至約 $+150^{\circ}C$ ，且當需要時在低於壓力下之密閉反應器中，在惰性氣體環境中及 / 或無水條件下。該溶劑類或稀釋劑類之說明實例為：芳香族，脂肪族與脂環族碳氫化合物以及經鹵化之碳氫化合物例如苯，甲苯，二甲苯，氯苯，溴

五、發明說明(18)

苯，石油醚，己烷，環己烷，二氯甲烷，三氯甲烷，二氯乙烷或三氯乙烷；醚類例如二乙基醚，叔-丁基甲基醚，四氫呋喃或二氧陸環；酮類例如丙酮或甲基乙基酮；酒精類例如甲醇，乙醇，丙醇，丁醇，乙二醇或丙三醇；酯類例如乙酸乙酯，乙酸丁基酯；鹽胺類例如N，N-二甲基甲鹽胺，N，N-二甲基乙鹽胺，N-甲基吡咯烷酮或六甲基磷三鹽胺；腈類例如乙腈；以及亞礬類例如二甲基亞礬。使用過量之鹼類，例如三乙基胺，吡啶，N-甲基嗎啉基或N，N-二乙基苯胺，亦可被使用作為溶劑類或稀劑類。合適之鹼類之說明實例為氫氧化物類，氫化物類，鹽胺類，烷醇鹽類，碳酸鹽類，鹼金屬類或鹼土金屬類之二烷基鹽胺類或烷基甲矽烷基鹽胺類，烷基胺類，亞烷基二胺類，環烷基胺類或N-烷基化且未飽和之或飽和之環烷基胺類，未飽和的或飽和的鹼性雜環類，氫氧化銨類以及碳環胺類。該鹼類之典型實例為氫氧化鈉，氫化鈉，胺基化鈉，甲醇酸鈉，碳酸鈉，叔-丁醇酸鉀以及碳酸鉀鹽，二異丙基鹽胺鎂，雙(三甲基甲矽烷基)鹽胺鉀，氫化鈣，三乙基胺，三伸乙基二胺，環己基胺，N-環己基-N，N-二甲基胺，N，N-二乙基苯胺，吡啶，4-(N，N-二甲基胺基)吡啶，N-甲基嗎啉基，苄基三甲基銨氫氧化物以及1，8-二氮雜雙環[5·4·0]十一碳-5-烯(DBU)。

選擇性地，此反應可在有機性溶劑中相轉移催化作用

五、發明說明(19)

下加以施行，如亞甲基氯或甲苯，在一鹼性水溶液存在下，如氫氧化鈉溶液，一相轉移觸酶，如硫酸氫四丁基銨。

已知可使用 N- (4-吡啶基) 巯基胺作為殺害蟲劑，特別是得自專利申請 WO 93/04580。本發明之式 I 化合物結構上與這些化合物在特徵上有所不同。式 I 之化合物可被使用於農業以及相關領域作為害蟲控制劑以控制植物害蟲。其可經由在低濃度之最佳活性加以區別，其可被植物良好地接受且為環境上安全的。其具有非常有用的治療性，預防性以及，特別地，系統性特質，且可被使用於保護許多的栽培植物。式 I 之化合物可被使用來抑制或破壞害蟲，其發生於有用植物之不同收穫作物中之植物或植物的部分上（果實，花朵，葉子，莖，塊莖，根），而在同時植物之部分，其在稍後亦會生長，可被保護以免於例如被植物致病性微生物蔓延。

式 I 之化合物可被使用作為種子被覆劑類以保護種子（果實，塊莖，穀粒）以及植物截枝對抗黴菌的感染以及對抗發生於土壤中之植物致病性黴菌。

式 I 之化合物可有效地對抗植物致病性黴菌，其屬於以下各綱：不完全真菌綱（Fungi imperfecti）（例如 Botrytis, Pyricularia, Helminthosporium, Fusarium

五、發明說明 (>°)

， *Septoria*， *Cercospora* 及 *Altemaria*) ， 及擔子菌綱 (*Basidiomycetes*) (例如 *Rhizoctonia*， *Hemileia*， *Puccinia*) 。 其亦能有效對抗子囊菌綱 (*Ascomycetes*) (例如 *Venturia* 及 *Erysiphe*， *Podospaera*， *Monilinia* 及 *Uncinula*) 且特別地可對抗卵孢菌 (*Oomycetes*) (例如 *Phytophthora*， *Pythium* 及 *Plasmopara*) 。

式 I 之化合物亦有利於害蟲之控制以控制農業收穫作物及景觀植物上之昆蟲及 / 或蟎，特別是在棉花，蔬菜及水果作物方面，在森林方面，在保護貯存產品及物質方面，以及在衛生範疇，以及用於控制動物害蟲方面，其特別是在家畜及生產性家畜方面。式 I 化合物之活性可由立即地或有時稍後殺死害蟲，例如在翅變時或減少卵產生及 / 或孵化率而可看出。

動物害蟲典型地包括鱗翅目 (*Lepidoptera*) ，鞘翅目 (*Coleoptera*) ，同翅目 (*Orthoptera*) ，等翅目 (*Isoptera*) ，蟎目 (*Acarina*) (如 *Boophilus spp.*) 等目。

在此中揭示之合適於植物保護用途的目標作物典型地包括於本發明範疇內之下列植物種類：穀物類 (小麥，大

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

號

五、發明說明 (> /)

麥，裸麥，燕麥，稻米，玉米，高粱及相關品種)；甜菜 (甜菜及飼料 (fodder) 甜菜)，梨果類，堅果類及軟果 (蘋果類，梨類，桃類，水蜜桃類，杏仁類，櫻桃類，草莓類，醋栗類，懸鉤子類 (raspberry) 及藍莓類)；豆科植物類 (豌豆，金麥豌豆 (lentil)，青豆，黃豆)；油脂作物類 (油菜，芥菜，罌粟，橄欖，向日葵，椰子，蓖麻植物，可可亞，花生)，葫蘆類 (黃瓜類，南瓜類，甜瓜類)；纖維性植物 (棉花，亞麻，麻，黃麻)；柑桔屬 (citrus) 水果 (橘類，檸檬類，葡萄柚，酸橙類)；蔬菜類 (菠菜，萵苣，蘆筍類，包心菜類，胡蘿蔔類，洋蔥類，番茄類，馬鈴薯類，甜椒類)；月桂科 (lauraceae) (酪梨類 (avocado)，桂皮，樟腦)，以及一些農作物類例如煙草，胡桃，咖啡，茄科，甘蔗，茶葉，胡椒，藤類，蛇麻類 (hops)，芭蕉科植物，及天然橡膠植物類及觀賞植物類。

式 I 之化合物通常以組合物的形式加以施用，且可與進一步的化合物同時地或連續使用於待處理的農作物區域或植物上。這些進一步的化合物可以是肥料或微量元素提供者以及其他影響植物生長的製劑類。就此而言，其亦可使用選擇性的除草劑類，殺昆蟲藥劑類，殺真菌藥劑類，殺細菌藥劑類，殺線蟲藥劑類，殺蝸牛藥劑類或這些製劑中數種之混合物，並與調劑的技藝中所習用的選擇性載劑類

五、發明說明 (>>)

，界面活性劑類或其他增進應用的添加物類聯合使用。

合適的載劑類與添加物類可為固體或液體且相關於在調劑技術中經常採用的合適物質，其包括天然或再製造之礦物質類，溶劑類，分散劑類，濕潤劑類，膠黏劑類，增稠劑類，結合劑類或肥料類。

一種施用式 I 化合物，或包括至少一種該化合物之農業組成物的偏好方法，為施用到葉子上。施用頻率與施用速度視相關致病原所引起之大量感染的危險性而定。或者，式 I 之化合物亦可以經土壤由根到達植物（系統性施用），其藉由以一液體製備物浸泡植物區域，或藉由將固體形式的化合物施用至土壤中，例如為顆粒形式（土壤性施用）。在踐踏性植物的情況下，此種顆粒可被施用至淹沒的水稻田。式 I 之化合物亦可施用於種子上（包覆），其藉由以該殺菌劑之液體製劑浸泡種子或塊莖或以固體製劑將其包覆。

式 I 之化合物被使用作為單一之活性成分或，偏好地，與其他在調劑學技藝中習用之輔劑一起聯用。到最後其以一習知的方式被有利地調製成為可乳化性濃縮劑類，可包覆性糊狀物類，可直接噴灑或稀釋的溶液類，稀釋之乳化劑類，可濕潤之粉末類，可溶解之粉末類，粉塵類，顆

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

第

訂

五、發明說明 (>?)

粒類，以及封入於聚合性的物質。就組成物之型式而言，施用方法，例如，噴灑，霧化，塵化，散佈，塗抹其上或傾倒的方法，均依據想要之目的及盛行的環境而加以選擇。

施用之有利比率通常是每公頃 (ha) 自 5 公克到 2 公斤之活性成份 (a. i.)，偏好為自 10 公克到 1 公斤之活性成份 / 公頃，最偏好自 20 公克到 600 公克之活性成份 / 公頃。當作為種子被覆劑使用時，有利的施用比率為每公斤種子自 10 毫克到 1 公克之活性成份。

該配方類，即包含式 I 化合物，若有需要，以及一固體或液體添加物之組成物類，製劑類或混合物類，係以一已知的方式加以製備，方便地藉由利用擴散劑類均質地混合及 / 或研磨該活性成分，該擴散劑類如溶劑類，固體載劑類及，在一些例子中，界面活性化合物類 (界面活性劑類)。

合適的溶劑類為：芳香性碳氫化合物類，包含 8 到 12 個碳原子的部份，典型地為二甲苯混合物或經取代之萘類，酞酸酯類如酞酸二丁基酯或酞酸二辛基酯，脂肪性碳氫化合物類如環己烷或石臘類醇類；及酒精與乙二醇類以及其醚類及酯類，如乙醇，伸乙烯乙二醇，2-甲氧基乙醇或 2-乙

五、發明說明 (>4)

氧基乙醇，酮類如環己酮，強烈極性溶劑類，如 N-甲基-2-吡咯酮，磺酸二甲基酯或二甲基甲酰胺，及植物油類或環氧化之植物油類如環氧化椰子油或黃豆油；或水。

針對細末類及可散佈之粉末類典型使用的固體載劑類通常為磨碎之天然礦物質填充物如方解石 (calcite)，滑石，高嶺土 (kaolin)，蒙脫土 (montmorillonite) 或美國活性白土 (attapulgite)。為了改善其物理特性，亦有可能加入高度散佈之矽化合物或高度吸收性之聚合物。合適的顆粒狀吸收性載體類為多孔性型態例如浮石 (pumice)，碎磚，海泡石 (sepiolite) 或膨潤土 (bentonite)；且合適的為非吸收性載體材料，例如，為方解石或砂。進而，可使用具無機或有機特性本質之大量先成顆粒狀材料，如特別是白雲石 (dolomite) 或粉碎之植物殘留物類。

依據欲調製之式 I 化合物之本質，合適之界面活性化合物類為非離子性，陽離子性及 / 或陰離子性活性劑類，其具有良好之乳化，散佈及濕潤特性。專有名詞“界面活性劑類”亦可被瞭解為包含活性劑類的混合物類。

合適之陰離子性界面活性劑類可以為水溶性皂類以及水溶性人工合成之界面活性化合物類。

五、發明說明 (>>)

非離子性界面活性劑類之典型實施例為壬基酚聚乙氧基乙醇類，蓖麻油聚乙二醇醚類，聚丙烯與聚環氧乙烷之聚加成物類，三丁基苯氧聚伸乙烯乙醇，聚伸乙烯乙二醇以及辛基苯氧基聚乙氧基乙醇。

陽離子性界面活性劑類偏好為四級銨鹽類，其帶有至少一 $C_8 - C_{22}$ 烷基團作為 N-取代基類且，選擇性之較低鹵化的烷基，苄基或較低級羥基烷基團作為進一步之取代物。

其他在調劑之技藝中所習用的進一步界面活性劑類已為嫻於此技藝者所熟知或可以在相關的文獻中發現。

農業化學組成物通常包含 0.1 到 99% 重量百分比，偏好 0.1 到 95% 重量百分比之式 I 化合物，含 99.9% 到 1% 重量百分比，偏好 99.8 到 5% 重量百分比之固體或液體添加物，以及含 0 到 25% 重量百分比，偏好 0.1 到 25% 重量百分比之界面活化劑。

然而商業化產品將偏好被調製成為濃縮物，最後的消費者一般將會使用稀釋的配方。

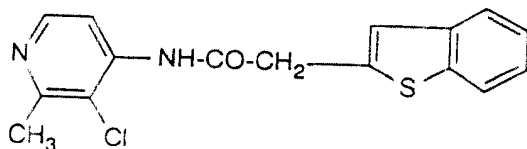
五、發明說明 (>6)

該組合物類亦可進而包含例如安定劑類，防泡沫劑類，黏稠度調節劑類，結合劑類，膠黏劑類以及肥料及其他化學藥劑類之成份以達到特定之效果。

本發明藉由下列非限制性實施例加以更仔細地說明。採用下列的縮寫：Ac=乙醯基；Et=乙基；i-Pr=異丙基；Me=甲基；Ph=苯基；Pr=n-丙基；Bu=n-丁基；m.p.=溶點。DS=立體異構物；Reg=區異構物。“NMR”意為“核磁共振光譜”。MS=質量光譜。“%”意謂“重量百分比”，除非使用相異的單位來表示相關的濃度。

本發明的化合物類之製備

實施例 P-1 (化合物 1.9) 2-(苯並[b]苯硫-2-基)-N-(3-氯-2-甲基吡啶-4-基)乙醯胺



0.71公克 (0.005M) 之 4-胺基-3-氯-2-甲基吡啶，0.96公克 (0.005M) 之 2-基乙醯胺

五、發明說明(> 7)

以及 0.97 公克 (0.0046M) 之 N, N-二環己基碳化二亞胺 (DCC) 於 30 毫升之絕對亞甲基氯中在 20 至 25° 無水條件下進行攪拌達 18 小時。反應混合物經過濾且亞甲基氯於噴水真空下加以除去。殘餘物為經由於矽凝膠 (洗提劑：乙酸乙酯 / 己烷 1: 1) 上進行管柱色層分析，產生 2- (苯並 [b] 苯硫 - 2- 基) - N- (3- 氯 - 2- 甲基吡啶 - 4- 基) 乙醯胺之黃色粉末，其具有熔點 150 至 152 °C。

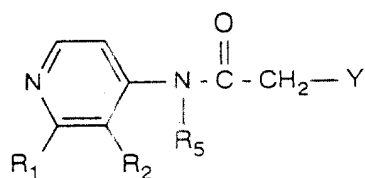
下列表中所陳列之化合物可以相似的方式加以製備。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (> 8)

表 1



Ex.No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. Data
1.1	Me	Cl	H		m.p. 149-150°C
1.2	Et	Cl	H		
1.3	Me	Cl	H		
1.4	Me	Cl	H		
1.5	Me	Cl	H		m.p. 119-120°C
1.6	Me	Cl	H		m.p. 119-121°C
1.7	Me	Cl	H		

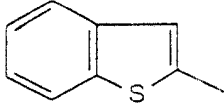
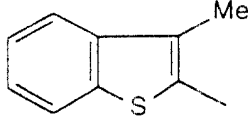
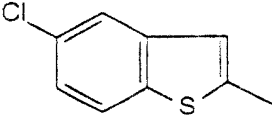
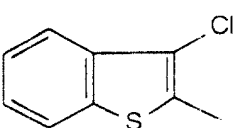
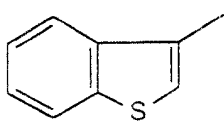
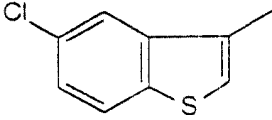
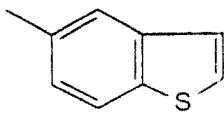
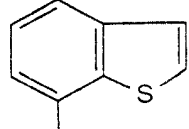
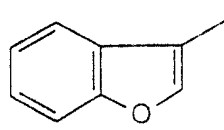
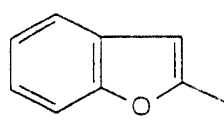
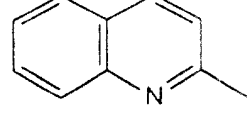
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

紉

五、發明說明 (29)

Ex. No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. data
1.8	Et	Cl	H		
1.9	Me	Cl	H		m.p. 143°C
1.10	Me	Cl	H		
1.11	Me	Cl	H		m.p. 164-166°C
1.12	Me	Cl	H		
1.13	Me	Cl	H		m.p. 150-152°C
1.14	Me	Cl	H		
1.15	Me	Cl	H		
1.16	Me	Cl	H		
1.17	Me	Cl	H		m.p. 132-133°C
1.18	Me	Cl	H		

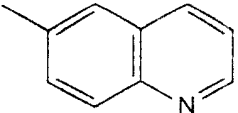
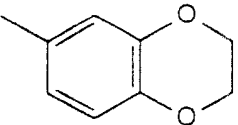
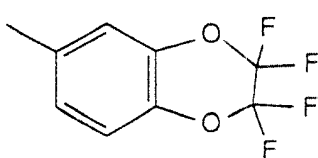
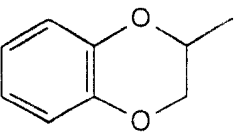
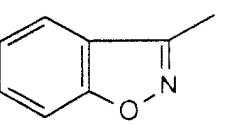
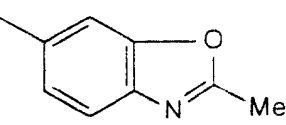
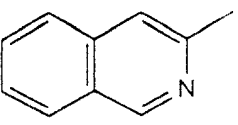
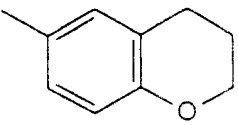
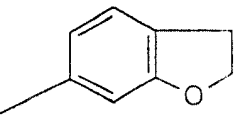
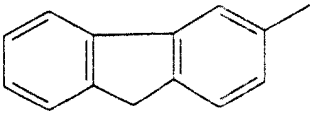
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (70)

Ex.No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. data
1.19	Me	Cl	H		
1.20	Me	Cl	H		m.p. 110-112°C
1.21	Me	Cl	H		
1.22	Me	Cl	H		
1.23	Me	Cl	H		m.p. 167-169°C
1.24	Me	Cl	H		
1.25	Me	Cl	H		
1.26	Me	Cl	H		m.p. 131-133°C
1.27	Me	Cl	H		
1.28	Me	Cl	H		

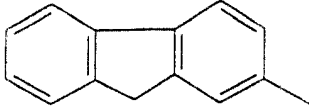
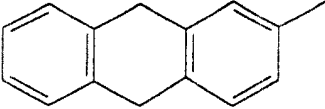
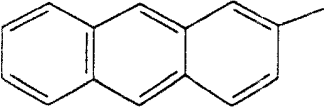
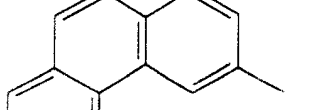
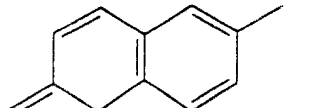
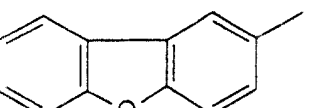
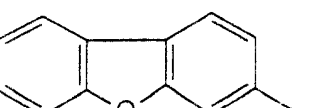
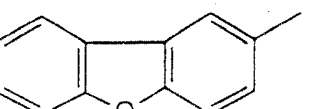
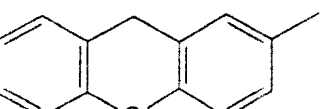
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

系

五、發明說明 (> /)

Ex. No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. data
1.29	Me	Cl	H		m.p. 159-160°C
1.30	Me	Cl	H		
1.31	Me	Cl	H		
1.32	Me	Cl	H		m.p. 166-167°C
1.33	Me	Cl	H		
1.34	Me	Cl	H		m.p. 197-199°C
1.35	Me	Cl	H		
1.36	Me	Br	H		
1.37	Me	Cl	H		m.p. 182-185°C

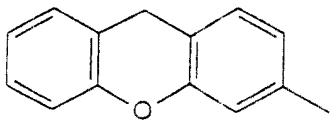
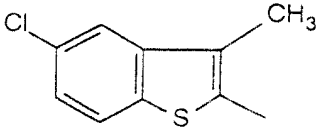
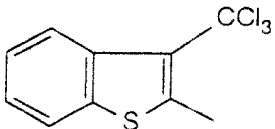
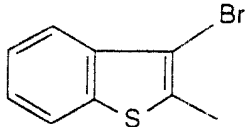
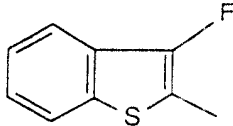
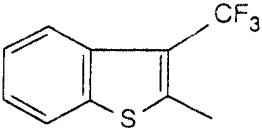
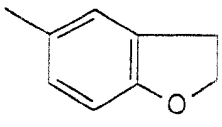
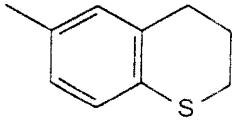
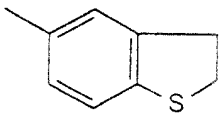
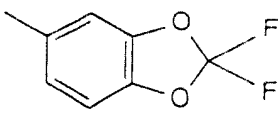
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

系

五、發明說明 (> >)

Ex.No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. data
1.38	Me	Cl	H		
1.39	Me	Cl	H		m.p. 160-162°C
1.40	Me	Cl	H		
1.41	Me	Cl	H		m.p. 162-165°C
1.42	Me	Cl	H		
1.43	Me	Cl	H		
1.44	Me	Cl	H		
1.45	Me	Cl	H		m.p. 125-127°C
1.46	Me	Cl	H		
1.47	Me	Cl	H		

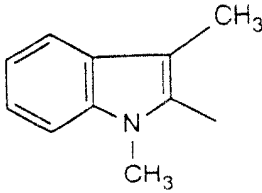
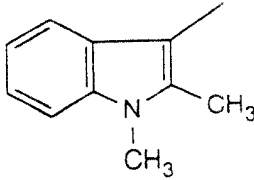
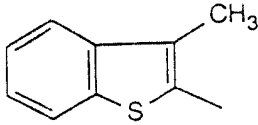
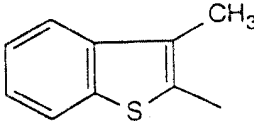
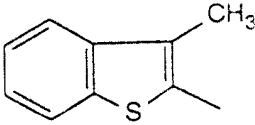
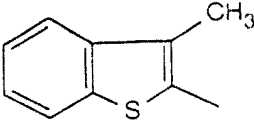
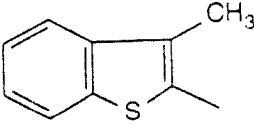
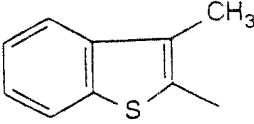
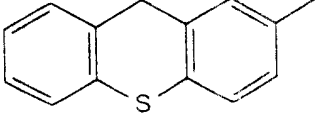
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (→)

Ex. No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. data
1.48	Me	Cl	H		
1.49	Me	Cl	H		
1.50	Me	Cl	Me		m.p. 129-131°C
1.51	Me	Cl	CH ₂ CH=CH ₂		oil
1.52	Me	Cl	CH ₂ C≡CH		
1.53	Me	Cl	CH ₂ CN		oil; ¹ H-NMR
1.54	Me	Cl	CH ₂ COOMe		oil; ¹ H-NMR
1.55	Me	Cl	CH ₂ COOH		
1.56	Me	Cl	H		m.p. 138-140°C

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

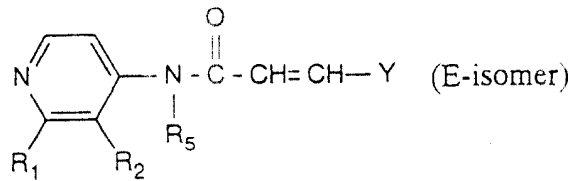
裝

訂

號

五、發明說明(→)

表2



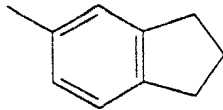
Ex. No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. Data
---------	----------------	----------------	----------------	---	------------

2.1

Me

Cl

H

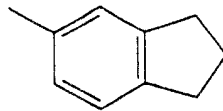


2.2

Et

Cl

H

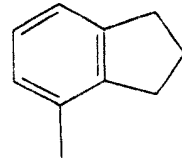


2.3

Me

Cl

H

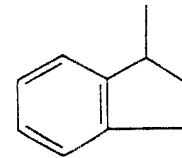


2.4

Me

Cl

H

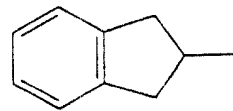


2.5

Me

Cl

H

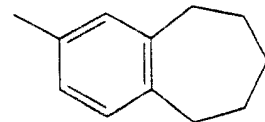


2.6

Me

Cl

H

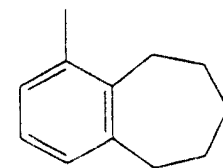


2.7

Me

Cl

H



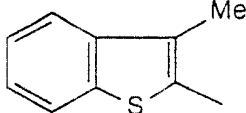
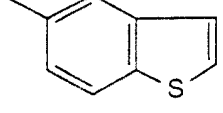
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表

訂

系

五、發明說明(75)

Ex.No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. data
2.8	Et	Cl	H		
2.9	Me	Cl	H		
2.10	Me	Cl	H		
2.11	Me	Cl	H		
2.12	Me	Cl	H		
2.13	Me	Cl	H		
2.14	Me	Cl	H		
2.15	Me	Cl	H		
2.16	Me	Cl	H		
2.17	Me	Cl	H		
2.18	Me	Cl	H		

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (續)

Ex. No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. data
2.19	Me	Cl	H		
2.20	Me	Cl	H		
2.21	Me	Cl	H		
2.22	Me	Cl	H		
2.23	Me	Cl	H		
2.24	Me	Cl	H		
2.25	Me	Cl	H		
2.26	Me	Cl	H		
2.27	Me	Cl	H		
2.28	Me	Cl	H		

(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)

Ex.No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. data
2.29	Me	Cl	H		
2.30	Me	Cl	H		
2.31	Me	Cl	H		
2.32	Me	Cl	H		
2.33	Me	Cl	H		
2.34	Me	Cl	H		
2.35	Me	Cl	H		
2.36	Me	Br	H		
2.37	Me	Cl	H		

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

家

訂

五、發明說明 (→8)

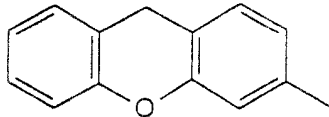
Ex. No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. data
---------	----------------	----------------	----------------	---	------------

2.38

Me

Cl

H

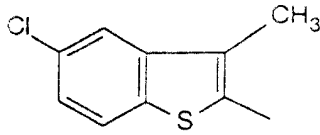


2.39

Me

Cl

H



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

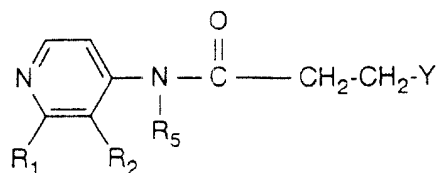
裝

訂

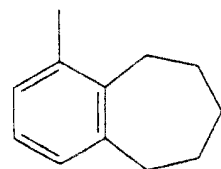
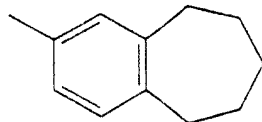
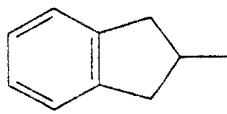
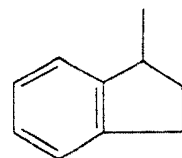
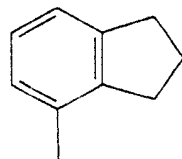
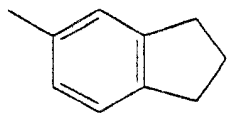
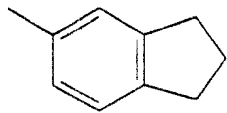
為

五、發明說明(29)

表3



Ex. No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. Data
3.1	Me	Cl	H		
3.2	Et	Cl	H		
3.3	Me	Cl	H		
3.4	Me	Cl	H		
3.5	Me	Cl	H		
3.6	Me	Cl	H		
3.7	Me	Cl	H		



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

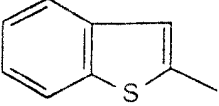
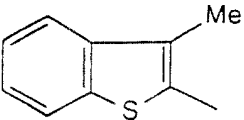
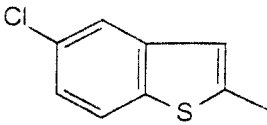
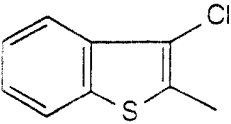
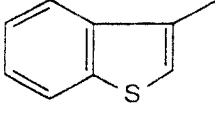
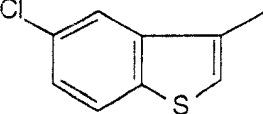
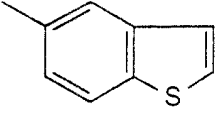
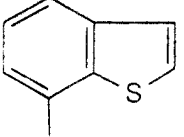
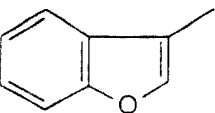
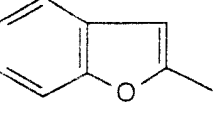
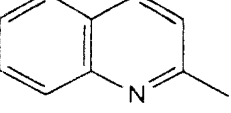
裝

訂

線

五、發明說明(40)

Ex. No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. data
---------	----------------	----------------	----------------	---	------------

3.8	Et	Cl	H	
3.9	Me	Cl	H	
3.10	Me	Cl	H	
3.11	Me	Cl	H	
3.12	Me	Cl	H	
3.13	Me	Cl	H	
3.14	Me	Cl	H	
3.15	Me	Cl	H	
3.16	Me	Cl	H	
3.17	Me	Cl	H	
3.18	Me	Cl	H	

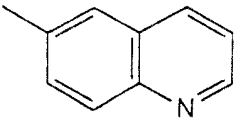
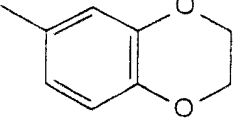
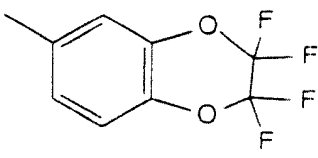
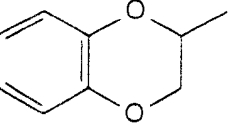
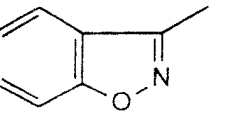
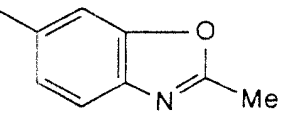
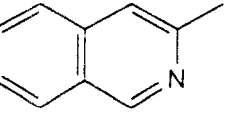
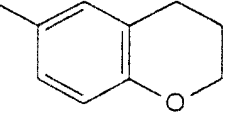
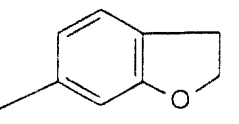
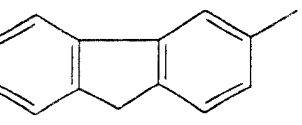
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

3.

五、發明說明(4)

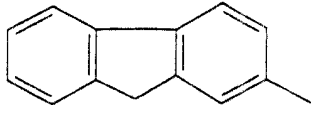
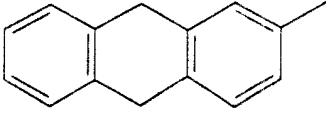
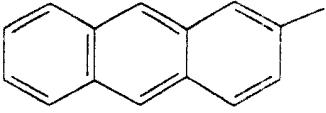
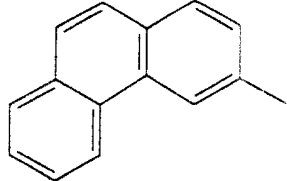
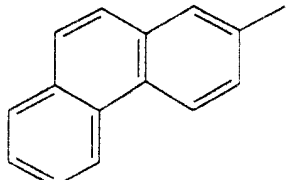
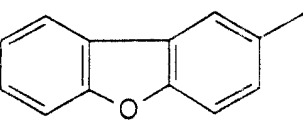
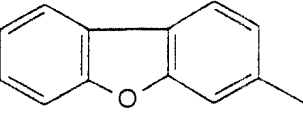
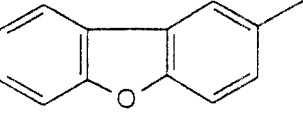
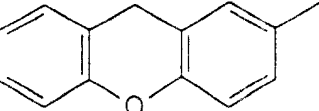
Ex. No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. data
3.19	Me	Cl	H		
3.20	Me	Cl	H		
3.21	Me	Cl	H		
3.22	Me	Cl	H		
3.23	Me	Cl	H		
3.24	Me	Cl	H		
3.25	Me	Cl	H		
3.26	Me	Cl	H		
3.27	Me	Cl	H		
3.28	Me	Cl	H		

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明(4)

Ex. No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. data
3.29	Me	Cl	H		
3.30	Me	Cl	H		
3.31	Me	Cl	H		
3.32	Me	Cl	H		
3.33	Me	Cl	H		
3.34	Me	Cl	H		
3.35	Me	Cl	H		
3.36	Me	Br	H		
3.37	Me	Cl	H		

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

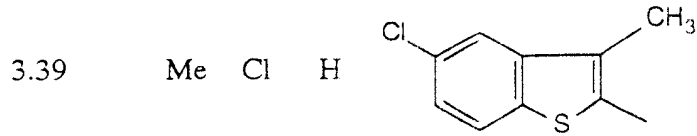
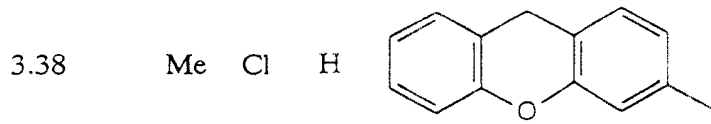
裝

訂

點

五、發明說明 (47)

Ex. No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. data
---------	----------------	----------------	----------------	---	------------



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

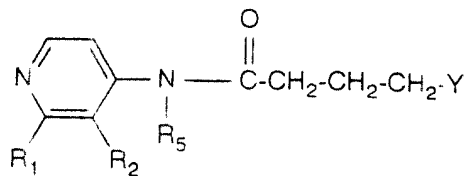
裝

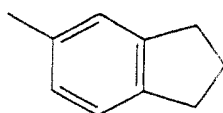
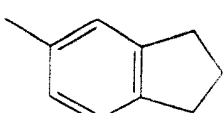
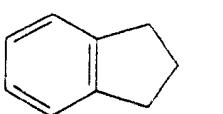
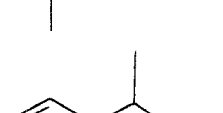
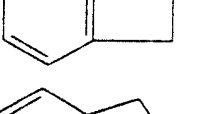
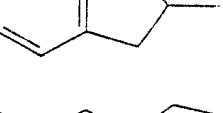
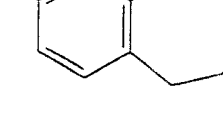
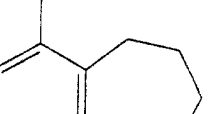
訂

系

五、發明說明(續)

表4



Ex. No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. Data
4.1	Me	Cl	H		
4.2	Et	Cl	H		
4.3	Me	Cl	H		
4.4	Me	Cl	H		
4.5	Me	Cl	H		
4.6	Me	Cl	H		
4.7	Me	Cl	H		
4.8	Et	Cl	H		

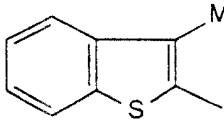
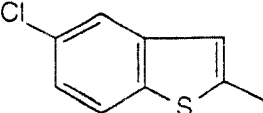
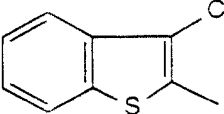
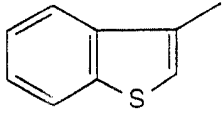
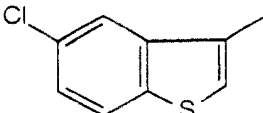
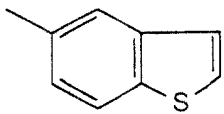
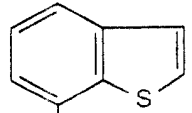
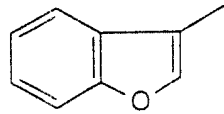
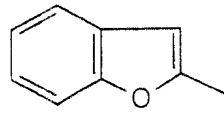
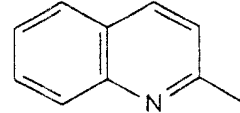
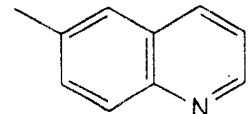
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表

訂

五、發明說明 (25)

Ex. No. R₁ R₂ R₅ Y Phys. data

4.9	Me	Cl	H	
4.10	Me	Cl	H	
4.11	Me	Cl	H	
4.12	Me	Cl	H	
4.13	Me	Cl	H	
4.14	Me	Cl	H	
4.15	Me	Cl	H	
4.16	Me	Cl	H	
4.17	Me	Cl	H	
4.18	Me	Cl	H	
4.19	Me	Cl	H	

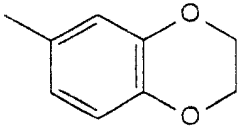
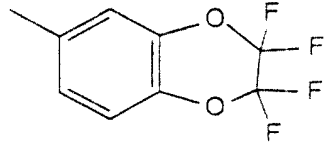
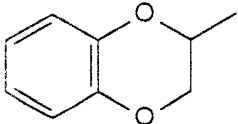
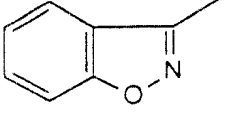
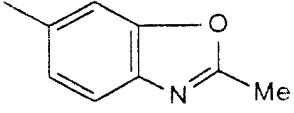
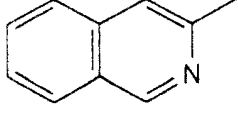
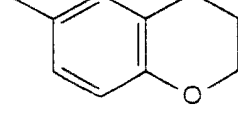
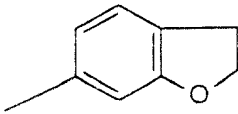
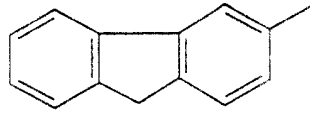
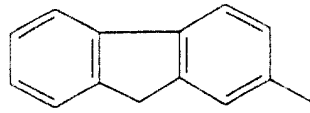
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表

訂

第

五、發明說明 (46)

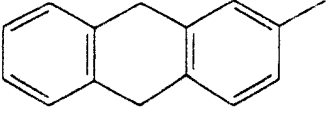
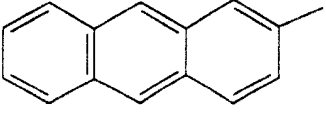
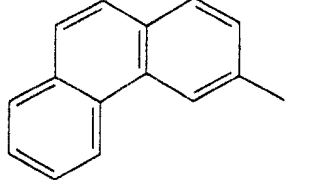
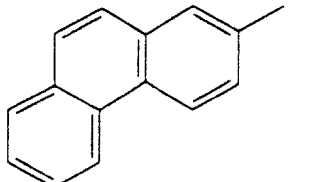
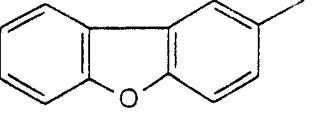
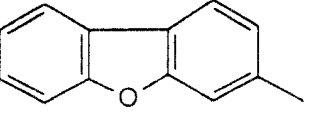
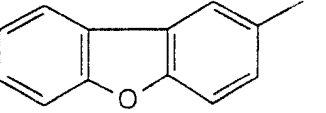
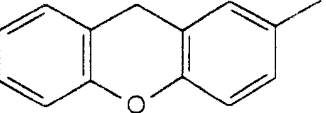
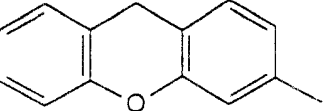
Ex. No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. data
4.20	Me	Cl	H		
4.21	Me	Cl	H		
4.22	Me	Cl	H		
4.23	Me	Cl	H		
4.24	Me	Cl	H		
4.25	Me	Cl	H		
4.26	Me	Cl	H		
4.27	Me	Cl	H		
4.28	Me	Cl	H		
4.29	Me	Cl	H		

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表
訂

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明(47)

Ex. No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. data
4.30	Me	Cl	H		
4.31	Me	Cl	H		
4.32	Me	Cl	H		
4.33	Me	Cl	H		
4.34	Me	Cl	H		
4.35	Me	Cl	H		
4.36	Me	Br	H		
4.37	Me	Cl	H		
4.38	Me	Cl	H		

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表

訂

結

五、發明說明 (48)

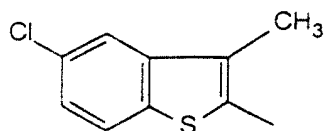
Ex. No.	R ₁	R ₂	R ₅	Y	Phys. data
---------	----------------	----------------	----------------	---	------------

4.39

Me

Cl

H



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

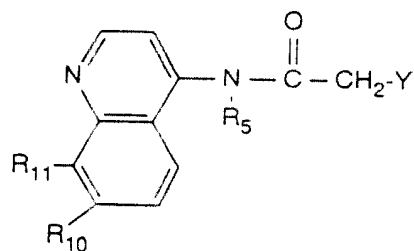
裝

訂

紮

五、發明說明(49)

表5



Ex. No.	R ₅	R ₁₀	R ₁₁	Y	Phys. Data
5.1	H	Cl	H		
5.2	H	H	F		m.p. 205-206°C
5.3	H	H	F		
5.4	H	H	F		m.p. 174-177°C
5.5	H	H	F		
5.6	H	H	F		
5.7	H	H	F		

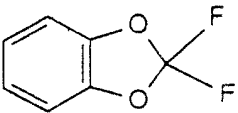
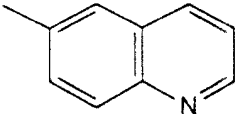
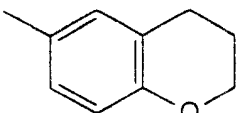
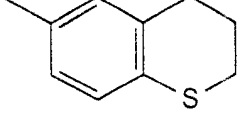
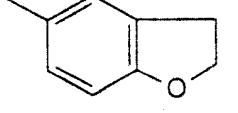
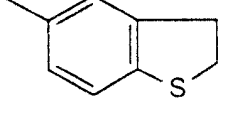
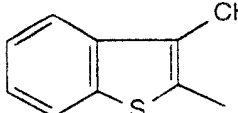
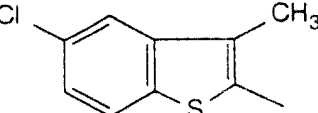
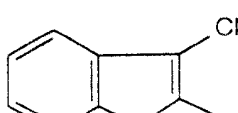
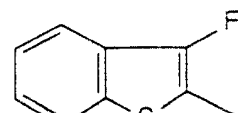
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

號

五、發明說明 (50)

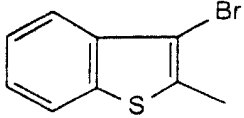
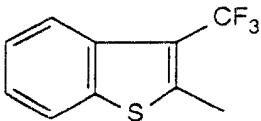
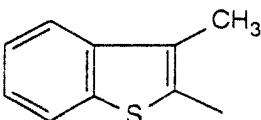
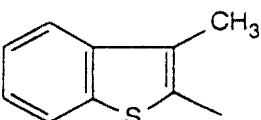
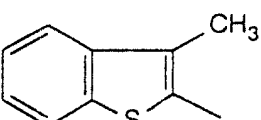
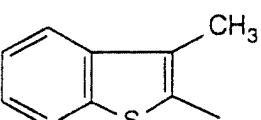
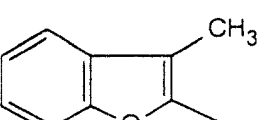
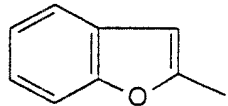
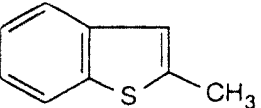
Ex. No.	R ₅	R ₁₀	R ₁₁	Y	Phys. data
5.8	H	H	F		
5.9	H	H	F		
5.10	H	H	F		m.p. 180-182°C
5.11	H	H	F		m.p. 188-190°C
5.12	H	H	F		m.p. 195-198°C
5.13	H	H	F		
5.14	H	H	F		m.p. 193-197°C
5.15	H	H	F		resin; ¹ H-NMR
5.16	H	H	F		
5.17	H	H	F		

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表
訂

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (5/)

Ex. No.	R ₅	R ₁₀	R ₁₁	Y	Phys. data
5.18	H	H	F		
5.19	H	H	F		
5.20	H	H	H		
5.21	H	Cl	H		m.p. 212-215°C
5.22	H	F	F		m.p. 201-204°C
5.23	H	H	Cl		m.p. 190-191°C
5.24	H	H	F		
5.25	H	H	F		
5.26	H	H	F		

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

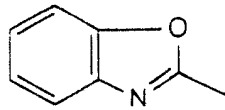
訂

外

五、發明說明 (5²)

Ex. No.	R ₅	R ₁₀	R ₁₁	Y	Phys. data
---------	----------------	-----------------	-----------------	---	------------

5.27	H	H	F		
------	---	---	---	--	--



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

紉

五、發明說明(57)

表 6 :

實施例 號碼	¹ H-NMR 數據 (ppm / 多樣性 / 質子數目) 溶劑 : CDCl ₃
5 · 15	2 · 44 / s / 3H ; 4 · 14 / s / 2H ; 6 · 98 / m / 1H ; 7 · 30 - 7 · 45 / m / 3H ; 7 · 73 / d / 1H ; 7 · 80 / d / 1H ; 8 · 19 / s / 1H (NH) ; 8 · 38 / dxd / 1H ; 8 · 90 / d / 1H

式. I 化合物之配製實例

實施例 F-1 · 1 至 F-1 · 3 : 可乳化性濃縮物類

成份	F-1 · 1	F-1 · 2	F-1 · 3
表中之化合物	25%	40%	50%
十二烷基苯磺酸鈣	5%	8%	6%
聚乙氧基化蓖麻油 (36 莫耳 EO 單位)	5%	—	—
三丁基苯氧基聚乙氧基 乙醇 (30 莫耳 EO 單位)	—	12%	4%

五、發明說明 (54)

環己酮	-	15%	20%
二甲苯混合物	65%	25%	20%

任何想要濃度之乳化劑類可經由利用水稀釋該濃縮物加以製備。

實施例 F-2：可乳化性濃縮物

成份	F-2
表中之化合物	10%
辛基苯氧基聚乙氧基乙醇 (4-5 莫耳 EO 單位)	3%
十二烷基苯磺酸鈣	3%
聚乙氧基化蓖麻油 (36 莫耳 EO 單位)	4%
環己酮	30%
二甲苯混合物	50%

任何想要濃度之乳化劑類可經由利用水稀釋該濃縮物加以製備。

實施例 F-3.1 至 F-3.4：溶液類

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表

訂

系

五、發明說明 (55)

成份	F-3.1	F-3.2	F-3.3	F-3.4
表中之化合物	80%	10%	5%	95%
聚乙二醇單甲基醚	20%	-	-	-
聚乙二醇 (相對分子質量： 400 原子質量單位)	-	70%	-	-
N-甲基吡咯烷-2-酮	-	20%	-	-
環氧化椰子油	-	-	1%	5%
石油溶劑 (沸騰範圍：160-190°)	-	-	94%	-

這些溶液類適合以微滴形式施用。

實施例 F-4.1 至 F-4.4：顆粒類

成份	F-4.1	F-4.2	F-4.3	F-4.4
表中之化合物	5%	10%	8%	21%
高嶺土	94%	-	79%	54%
高度分散之矽 化物	1%	-	13%	7%
美國活性白土	-	90%	-	18%

五、發明說明(56)

化合物被溶解於二氯甲烷中，將該溶液噴灑至載劑上
之後溶劑於真空下進行揮發。

實施例 F-5.1 與 F-5.2：粉塵類

成份	F-5.1	F-5.2
表中之化合物	2%	5%
高度分散之矽 化物	1%	5%
滑石	97%	-
高嶺土	-	90%

備用之粉塵類為經由密切地混合載劑類與化合物加以
得到。

實施例 F-6.1 至 F-6.3：可溼潤性粉末類

成份	F-6.1	F-6.2	F-6.3
表中之化合物	25%	50%	75%
木素磺酸鈉	5%	5%	-

五、發明說明 (57)

十二烷基硫酸鈉	3%	-	5%
二異丁基萘磺酸鈉	-	6%	10%
辛基苯氧基聚乙氧基乙醇 (7-8 莫耳 EO 單位)	-	2%	-
高度分散之矽化物	5%	10%	10%
高嶺土	62%	27%	-

所有的成份均加以混合且混合物於一合適的研磨器中充分研磨以得到可溼潤性粉末，其可利用水加以稀釋成為任何想要濃度之懸浮液。

生物性實施例：A 殺微生物活性

B-1：在小麥上對抗 *Puccinia graminis* 的活性

a) 殘留物保護活性

播種後6天，小麥植物以噴灑混合物水溶液（0.02% 活性成份）進行噴灑至滴落階段，該噴灑用混合物以試驗化合物之可濕潤粉末配方製備而成，且24小時後以該真菌之夏孢子（uredospore）懸浮液進行感染。培育48小時以後（環境：於20℃及大氣相對濕度95至100%），該植物被置入22℃的溫室中。真菌蔓延的評估是在感染後12天。

五、發明說明(58)

b) 系統性活性

播種五天後的小麥植物，以一噴灑用混合水溶液（含相對於土壤體積0.006%活性成份）進行浸泡，該噴灑用混合物以試驗化合物之可濕潤性粉末配方製備而成。小心操作使得該噴灑混合物不要接觸植物的生長部份。48小時以後，該植物以該真菌之夏孢子（uredospore）懸浮液進行感染。培育48小時以後（環境：於20℃及大氣相對濕度95至100%），該植物被置入22℃的溫室中。真菌蔓延的評估是在感染後12天。

實施例 B-2：在番茄植物上對抗 *Phytophthora infestans* 之活性

a) 殘留物保護活性

經過3週的生長期後，番茄植物以一噴灑用混合物（含0.02%之活性成分）進行噴灑，該噴灑用混合物以試驗化合物之可濕潤性粉末配方製備而成。24小時以後，該番茄植物以該真菌之孢子囊懸浮液進行感染。於20℃及大氣相對濕度90至100%下培育5天後對真菌蔓延的情形加以評估。

五、發明說明(59)

b) 系統性活性

經過3週的生長期後，番茄植物以一噴灑用混合物（含相對於土壤體積0.006%之活性成分）進行浸泡，該噴灑用混合物以活性成分之可濕潤之粉末製備而成。小心操作使得該噴灑混合物不要接觸植物的生長部份。48小時以後，該植物以該真菌之孢子囊懸浮液進行感染。於20℃及大氣相對濕度90至100%下培育5天後對真菌蔓延的情形加以評估。表中之化合物，特別是化合物1.1, 1.5, 1.6, 1.9, 1.23, 1.50, 1.53, 5.2, 5.45, 10, 5.11, 5.14, 5.15, 5.21均呈現良好的活性。

實施例 B-3: 在花生植物中對抗 *Cercospora arachidicola*的殘留物保護活性

具有高度10到15公分的花生植物以噴灑混合物水溶液（0.02%之活性成分）進行噴灑至滴落階段，該噴灑用混合物以試驗化合物之可濕潤性粉末配方製備而成且48小時以後以該真菌之分生孢子懸浮液進行感染。受感染之植物於約21℃及高度大氣濕度下培育72小時，然後置入溫室中直到典型損傷出現。感染後12天對殺真菌活性基於損傷的數目及大小加以評估。

五、發明說明(10)

實施例 B-4: 在葡萄類蔓藤上對抗 *Plasmopara viticola* 之活性

葡萄類蔓藤的幼苗在4-5片葉子的階段以一噴灑用混合物(含0.02ppm之活性成分)進行噴灑至滴落階段,該噴灑用混合物以試驗化合物之可濕潤性粉末配方製備而成且24小時後以該真菌之孢子囊懸浮液進行感染。於20℃及大氣相對濕度95至100%下培育6天後對真菌蔓延的情形加以評估。表中之化合物,特別是化合物1.1, 1.20, 1.23, 1.26, 1.50, 1.53, 1.53, 5.10, 5.11, 5.12, 5.22, 5.23均呈現良好的活性。

實施例 B-5: 在黃瓜上對抗 *Colletotrichum lagenarium* 的活性

黃瓜植物以一噴灑用混合物(濃度0.002ppm活性成份)進行噴灑,該噴灑用混合物以試驗化合物之可濕潤性粉末配方製備而成且2天後以該真菌之孢子懸浮液(1.5×10^5 孢子/毫升)進行感染,並在23℃及高大氣濕度下培育36小時。隨後在正常大氣濕度及約22℃下繼續培育。感染8天後對真菌蔓延的情形加以評估。表中之化合物呈現良好

五、發明說明 (b')

的活性。

實施例 B-6: 在蘋果新芽上對抗 *Venturia
inaequalis* 的殘留物保護活性

具有高度 10 到 20 公分新芽的蘋果截枝以噴灑混合物水溶液 (0.02% 之活性成分) 進行噴灑至滴落階段, 該噴灑用混合物以試驗化合物之可濕潤性粉末配方製備而成。24 小時以後, 該植物以該真菌之分生孢子懸浮液進行感染。然後該植物於一相對大氣濕度 90% 到 100% 下培育 5 天並置入 20 到 24°C 的溫室中再培育 10 天。感染後 12 天後, 對斑點的蔓延加以評估。表中之化合物, 特別是化合物 1.1, 1.5, 1.6, 1.9, 1.23, 1.50, 1.53, 5.2, 5.45, 10.5, 11, 14, 15, 21 均呈現良好的活性。

實施例 B-7: 在大麥上對抗 *Erysiphe graminis* 的活性

a) 殘留物保護活性

約 8 公分高的大麥植物以噴灑混合物水溶液 (0.02% 之活性成分) 進行噴灑至滴落階段, 該噴灑用混合物以試驗化合物之可濕潤性粉末配方製備而成且 3-4 小時以後,

五、發明說明 (b)

經處理的植物被撒滿真菌之分生孢子。受感染植物被置入 22℃ 的溫室中且感染後 10 天對真菌蔓延的情形加以評估。表中之化合物，特別是化合物 1·1, 1·5, 1·6, 1·9, 1·23, 1·50, 1·53, 5·2, 5·45, 10, 5·11, 5·14, 5·15, 5·21 均呈現良好的活性。

b) 系統性活性

約 8 公分高的大麥植物，以一噴灑用混合水溶液（含相對於土壤體積 0·002% 之活性成分）進行浸泡，該噴灑用混合物以試驗化合物之可濕潤性粉末配方製備而成。小心操作使得該噴灑混合物不要接觸植物的生長部份。48 小時以後，經處理的植物被撒滿真菌之分生孢子。受感染植物被置入約 22℃ 的溫室中並在感染後 12 天對真菌蔓延的情形加以評估。表中之化合物呈現良好的活性。

實施例 B-8：在蘋果新芽上對抗 *Podosphaera leucotricha* 的活性

約 15 公分高的蘋果截枝以噴灑混合物水溶液（0·06% 之活性成分）進行噴灑。24 小時以後，該植物以真菌之分生孢子懸浮液進行感染並放入 20℃ 及相對大氣濕度 70% 的

五、發明說明 (67)

培育箱中。感染後12天對真菌蔓延的情形加以評估。表中之化合物呈現良好的活性。

生物性實施例：B殺昆蟲活性

實施例B-9：對抗 *Nilparvata lugens* (昆蟲) 的活性

稻植物以一包括400ppm濃度之試驗化合物的水溶性乳化噴灑配方加以處理。當噴灑包覆物乾燥後，稻植物以第二期及第三期蝗幼蟲加以分佈。該試驗於21天後進行評估。族群減少的百分比(殺死百分比)為經由比較在處理植物及未處理植物上存活蝗蟲的數目加以決定。表中的化合物類達到超過90%的殺死率。

實施例B-10：對抗 *Plutella xylostella* 毛蟲(昆蟲)的活性

幼心小甘藍植物以一包括400ppm濃度之試驗化合物的水溶性乳化噴灑配方加以噴灑。當噴灑之包覆物乾燥時，該甘藍植物以10隻第三階段的 *Plutella xylostella* 的毛蟲加以分佈並置於塑膠容器中。該試驗於3天後進行評估。族群減少的百分比(殺死百分比)為經由比較在處理植物及

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(64)

未處理植物上死亡毛蟲及啃噬損傷的數目加以決定。表中之化合物呈現良好的活性。

實施例 B-11：對抗 *Musca domestica* (昆蟲) 的活性

一塊方糖以試驗化合物的溶液加以溼潤，方糖上的試驗化合物濃度為 250 ppm。該經處理的方糖與一溼潤之棉花球拭子及 10 隻成年 OP-抗藥株之 *Musca domestica* 一起置於一鋁盤上。該鋁盤以一玻璃燒杯加以覆蓋，並於 25°C 進行培育。24 小時以後決定其死亡率。表中之化合物，特別是化合物 1·1, 1·5, 1·6, 1·9, 1·23, 1·50, 1·53, 5·2, 5·45, 10·5, 11·5, 14·5, 15·5, 21·5 均呈現良好的活性。

生物性實施例：C 殺蟎活性

實施例 B-12：對抗 *Tetranychus urticae* (蟎) 的活性

幼小的豆植物以一混合之 *Tetranychus urticae* 族群加以分佈且，一天後，以含有 400 ppm 試驗化合物之噴灑乳化水溶液配方進行噴灑。該植物接著在 25°C 培養 6 天且

五、發明說明 (65)

之後加以評估。族群減少的百分比（殺死百分比）經由比較在處理植物及未處理植物上死蛋，幼蟲及成蟲的數目加以決定。表中之化合物呈現良好的活性。

實施例 B-13：對抗一稀釋系列之 *Tetranychus cinnabarinus*（蟎）的混合族群之活性

於 2-葉階段之矮種豆以一混合族群之 OP-容忍株之 *Tetranychus cinnabarinus* 株（卵，幼蟲／蛹，成蟲）進行散佈。感染 24 小時後，試驗化合物以自動噴灑箱使用劑量 200，100 及 50 毫克的活性成份／升進行自動噴灑。該試驗化合物經調劑並以水稀釋成為合適的濃度。施用後 2 及 7 天，該試驗針對卵，幼蟲／蛹及成蟲的殺死百分比進行評估。表中的化合物以稀釋達 50 毫克的活性成份／升顯示超過 70% 的殺死率。

實施例 B-14：對抗 *Boophilus microplus* 之活性

將飽食的雌扁蟲成蟲以膠帶固定在一 PVC 薄板上並以棉球拭子加以覆蓋。之後以 10 毫升包含 125 ppm 濃度之試驗化合物之水溶液浸泡棉球拭子來處理該試驗生物。然後除去棉球拭子並將扁蟲培育 4 週以產卵。活性是以雌蟲之被殺或不孕進行觀察，或採用對抗蟲卵之殺卵活性之形

五、發明說明(66)

式。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表

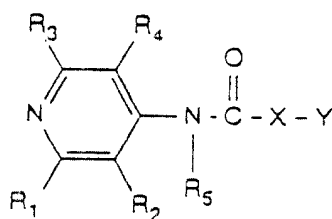
訂

頁

四、中文發明摘要 (發明之名稱:)

作為除害劑之 4 - 胺基吡啶衍生物

本發明相關於式 I 之化合物

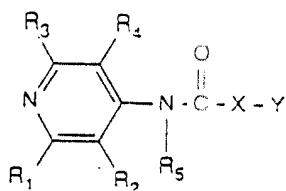


其中:

英文發明摘要 (發明之名稱: 4-Aminopyridine derivatives as pesticides)

Abstract of the Disclosure

The invention relates to compounds of formula I



wherein:

R_1 and R_2 are each independently of the other C_{11} - C_5 alkyl or halogen; or

R_1 and R_2 , taken together, form a saturated or unsaturated 6-membered carbocyclic ring;

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

四、中文發明摘要(發明之名稱:)

R_1 與 R_2 彼此獨立為 $C_1 - C_6$ 烷基，或鹵素；或

R_1 與 R_2 共同形成一飽和的或未飽和的 6 員之碳環；

R_3 與 R_4 彼此獨立為氫， $C_1 - C_6$ 烷基或鹵素；

R_5 為氫， $C_1 - C_6$ 烷基，其為未經取代之或經由氰基， $C_1 - C_2$ 烷氧基羰基， $C_2 - C_6$ 烯基，加以取代，

X 為 $-CH_2-$ 或 $-CH=CH-$

Y 為式 (a), (b), (c), (d), (e), (j), (k), (l), (n), (p),

(s), (u) 基團；

英文發明摘要(發明之名稱:)

R_3 and R_4 are each independently of the other hydrogen, $C_1 - C_6$ alkyl or halogen;

R_5 is halogen, $C_1 - C_6$ alkyl which is unsubstituted or substituted by cyano, $C_1 - C_2$ alkoxy carbonyl, $C_2 - C_6$ alkenyl;

X is CH_2 or $-HC=CH-$;

Y is a group of formulae (a), (b), (c), (d), (e), (j), (k), (l), (n), (p), (s), (u);

R_6 and R_7 are each independently of the other hydrogen, halogen, $C_1 - C_6$ alkyl;

The compounds are agrochemical control agents and are suitable for pest control.

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

四、中文發明摘要(發明之名稱:)

R₆ 與 R₇ 彼此獨立為氫，鹵素，C₁ - C₆ 烷基，
該化合物為農藥化學上之控制藥劑類且適合有害生物之
控制。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

英文發明摘要(發明之名稱:)

公告本

85年11月15日 修

申請日期	84. 8. 15
案 號	84108486
類 別	C07D ^{213/45} . A01N ^{43/40}

A4
C4

306916

306916

Int. Cl.

(以上各欄由本局填註)

發 明 專 利 說 明 書		
一、發明 名稱	中 文	作為除害劑之4-胺基吡啶衍生物
	英 文	4-Aminopyridine derivatives as pesticides
二、發明 創作人	姓 名	哈拉特·華特
	國 籍	德 國
	住、居所	瑞士4118洛德斯多夫, 希爾希瑪特街12B
三、申請人	姓 名 (名稱)	汽巴-嘉基股份有限公司
	國 籍	瑞 士
	住、居所 (事務所)	瑞士CH-4002巴賽爾, 克律貝街141號
	代 表 人 姓 名	威納·瓦得克

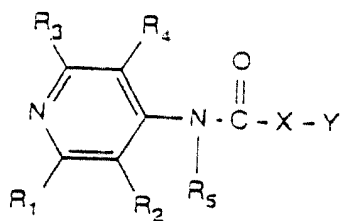
裝 訂 線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

86. 3. 27
年 月 日
補充

六、申請專利範圍

1. 一種式 I 之化合物



其中：

R_1 與 R_2 彼此獨立為 $C_1 - C_6$ 烷基，或鹵素；或

R_1 與 R_2 共同形成一飽和的或未飽和的 6 員之碳環；

R_3 與 R_4 彼此獨立為氫， $C_1 - C_6$ 烷基或鹵素；

R_5 為氫， $C_1 - C_6$ 烷基，其為未經取代之或經由氫基， $C_1 - C_2$ 烷氧基羰基， $C_2 - C_6$ 烯基，加以取代，

X 為 $-CH_2-$ 或 $-CH=CH-$

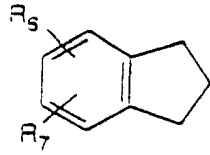
Y 為式 (a), (b), (c), (d), (e), (j), (k), (l), (n), (p), (s), (u) 基團；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

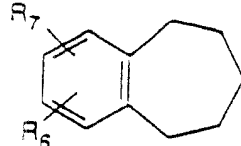
裝

訂

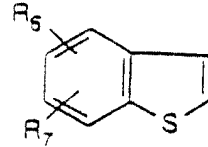
六、申請專利範圍



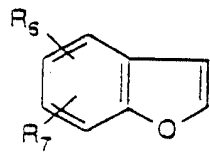
(a)



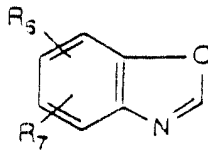
(b)



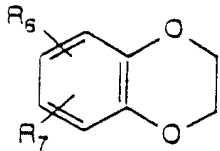
(c)



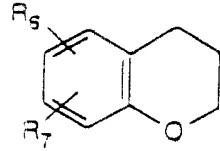
(d)



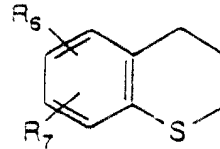
(e)



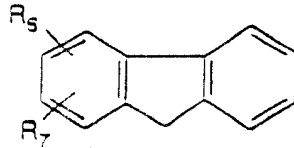
(j)



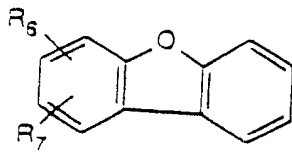
(k)



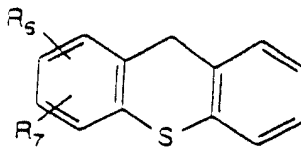
(l)



(n)



(p)



(u)

R_5 與 R_7 彼此獨立為氫，鹵素， $C_1 - C_6$ 烷基，或

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

紙

六、申請專利範圍

~~林~~
~~理~~
~~是~~
~~得~~
~~到~~
 其游離形式或鹽形式之異構體。
 殊
 校
 正
 專
 利

2. 根據申請專利範圍第1項之化合物，其中

R_1 為 $C_1 - C_4$ 烷基；

R_2 為鹵素；

R_3 以及 R_4 為氫；

R_5 為氫或 $C_1 - C_4$ 烷基；

X 為 $-CH_2-$ 或 $-CH=CH-$ 。

3. 根據申請專利範圍第2項之化合物，其中

R_1 為 $C_1 - C_4$ 烷基

R_2 為氯或溴；

R_3 以及 R_4 為氫；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

紙

六、申請專利範圍

R₅ 為氫；

X 為 $-\text{CH}_2-$ 。

4. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中

Y 為式 (a)，(b)，(n)，(u) 之等環基團；

R₆ 與 R₇ 彼此獨立為氫，氯，溴或 C₁ - C₂ 烷基。

5. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中

Y 為式 (c) 或 (d) 之雜環基團；

R₆ 與 R₇ 彼此獨立為氫，氯，溴或 C₁ - C₂ 烷基。

6. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中

R₁ 為甲基或乙基；

X 為式 $-\text{CH}_2-$ 之基團。

7. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其具有式 Ia

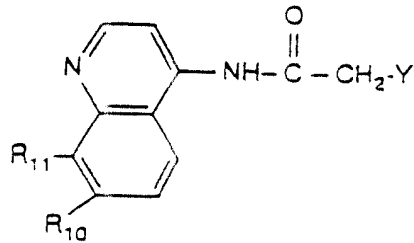
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

六、申請專利範圍



Ia

其中：

R_{10} 與 R_{11} 彼此獨立為氫，或鹵素；

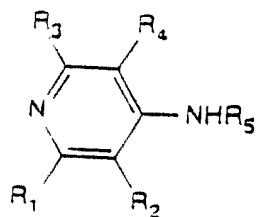
Y 為式 (a), (b), (c), (d), (e), (j), (k), (l), (n), (p), (s), (u) 之基團；

8. 一種用於製備如申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物之方法，其包括使式 II 之化合物



II

或其酸性鹵化物，其中 X 以及 Y 為如申請專利範圍第 1 項之式 I 之定義，與式 III 之化合物進行反應

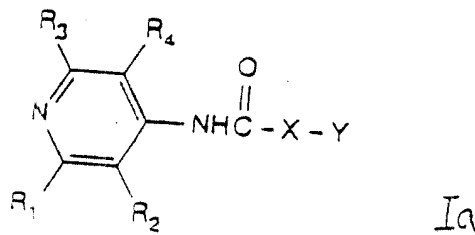


III

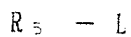
六、申請專利範圍

其中 R_1 至 R_5 具有如申請專利範圍第 1 項之式 I 所給予之意義，在合適的縮合劑及 / 或一鹼之缺乏或存在下，以得到式 I 之化合物。

9. 一種用於製備如申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物之方法，其中 R_5 如申請專利範圍第 1 項中所定義，但不為氫，其包括使式 Ia 之化合物



其中 R_1 至 R_4 ，X 與 Y 具有如申請專利範圍第 1 項之式 I 所給予之意義，與式 IV 之化合物進行反應



IV

其中 R_5 為如式 I 所定義，且 L 為離去性基團，在一鹼之存在下。

10. 一種用於控制有害生物之組成物，其包括至少一種如申請專利範圍第 1 項之化合物，其以游離形式或以農業

六、申請專利範圍

化學上可接受之鹽，與合適之載劑聯合作為活性成份。

11. 根據申請專利範圍第10項之組成物，其中欲控制之有害生物為植物致病性微生物。

12. 根據申請專利範圍第10項之組成物，其中欲控制之有害生物為昆蟲類或蟎。

13. 一種控制有害生物類之方法，其包括施用如申請專利範圍第1項中之除害有效量之化合物至該有害生物類或至其所在地。

14. 根據申請專利範圍第13項之方法，其中欲控制之有害生物為植物致病性微生物。

15. 根據申請專利範圍第13項之方法，其中欲控制之有害生物為昆蟲類或蟎。

16. 根據申請專利範圍第13項之方法，其如申請專利範圍第1項之除害有效量之化合物係施用於植物繁殖物質。

17. 根據申請專利範圍第16項之方法，其中該植物繁殖物質係指種子。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

紙