

公告本

240163

補充 57月8

申請日期	82. 7-3
案 號	82105312
類 別	007D > 11 / 6v MBIN 43/88

A4  
C4

(以上各欄由本局填註)

# 發明專利說明書

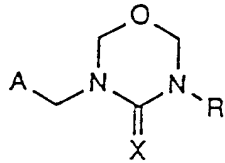
一、發明 名稱	中 文	1,3,5-噁二嗪衍生物,其製法,製法所用中間體,含該衍生物的殺虫組成物,以該衍生物控制害虫的方法
	英 文	1,3,5-Oxadiazine Derivatives, Process for Their Preparation, Pesticidal Compositions Containing Them, Method of Controlling Pests Using Them and Intermediates Used in Their Preparation
二、發明人 創作	姓 名	(1)彼得.麥恩費許 (2)羅倫斯.格西爾
	國 籍	瑞 士
三、申請人	住、居所	(1)瑞士4418洛得斯多夫.亞格頓街21號 (2)瑞士4056巴賽爾.麥恩街56號
	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

## 五、發明說明( )

本發明係關於一種下式化合物



(I)

其中

A 為一未取代或單取代到四取代的芳香系或非芳香系，單環或雙環雜環基，其中一到二個 A 取代基可選自鹵素 - C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> 烷基，環丙基，鹵素環丙基，C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> 烯基，C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> 炔基，鹵素 - C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> 烯基，鹵素 - C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> 炔基，鹵素 - C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> 烷氧基，C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - 烷基硫鈎，鹵素 - C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> 硫鈎，烯丙基氧基，炔丙基氧基，烯丙基硫鈎，炔丙基硫鈎，鹵素烯丙基氧基，鹵素烯丙基硫鈎，氧基和硝基，一到四個 A 取代基可選自 C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> 烷基，C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> 烷氧基和鹵素；

R 為氫，C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 烷基，苯基 - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 烷基，C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> 環烷基，C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> 烯基或 C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> 炔基；和 X 為 N - NO<sub>2</sub> 或 N - CN，

化合物為自由形態或鹽形態，若適當的話，其互變異構物，在每一種情況下為自由形態或鹽形態，其製備方法，這些化合物和其互變異構物的應用，一種殺虫劑，其活性成份係選自這些化合物和其互變異構物，在每一種情況下為自由形態或可供農化使用的鹽形態，製備這些組成物的方

## 五、發明說明( )

法和其應用，用這些組成物處理的植物繁衍部位，控制害虫方法，製備這些化合物的自由形態或鹽形態中間體，和適當的話，其自由形態或鹽形態互變異構物，以及製備中間體的方法和其應用。

某些噁二嗪衍生物在文獻中被建議作為殺虫劑中對節肢動物具活性的成份。然而，在害虫控制領域中，這些已知化合物的生物性質總是無法令人滿意，因此需要其它具殺虫性質的化合物，特別是用來控制昆虫，使用本發明的式 I 化合物就可達到此目的。

某些化合物 I 可以互變異構物形式存在，例如 R 為氫，然後相對應的化合物 I，亦即具 3 - H - 亞胺基 - 過氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪部份結構，可與相關的互變異構物達成均衡，其具備 4 - 胺基 - 1, 2, 5, 6 - 四氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪部份結構。據上所述，本文所述式 I 化合物，適當地，應該被了解是代表相對應的互變異構物，即使在後文的每一種情況下不再特別提起時也是如此。

式 I 化合物和，適當地，其互變異構物，可為鹽的形式。至少具一基本中心的式 I 化合物可以，例如，形成酸加成鹽。這些加成鹽乃形成，例如與強無機酸，例如礦物酸如硫酸，磷酸或一氫鹵素，與強有機羧酸，例如未取代或取代如鹵取代，C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 烷羧酸，例如醋酸，飽和或未飽和二羧酸，例如草酸，丙二酸，馬來酸或酞酸，羥基羧酸，例如抗壞血酸，乳酸，蘋果酸，酒石酸或檸檬酸，

## 五、發明說明(→)

羧酸，例如抗壞血酸，乳酸，蘋果酸，酒石酸或檸檬酸，或苯甲酸，或與有機磷醯酸，例如未取代或取代，例如鹵素取代， $C_1 - C_4$  烷-或芳基-磷醯酸，例如甲烷-或對-甲苯-磷醯酸。除此之外，具備至少一酸基的式 I 化合物可與鹼形成鹽。與鹼的合適鹽為金屬鹽，例如鹼金屬鹽或鹼土金屬鹽，例如鈉，鉀或鎂鹽，或與氨的鹽或一有機胺，例如嗎啉，吡啶，吡咯烷，一單低碳數烷基胺，或二低碳數烷基胺，或三低碳數烷基胺，例如乙基胺，二乙基胺，三乙基胺或二甲基-丙基胺，或一單羥基低碳數烷基胺，二羥基低碳數烷基胺，三羥基低碳數烷基胺，例如單乙醇胺，二乙醇胺或三乙醇胺。再者，也可能形成相對應的內鹽。在本發明的範圍中較佳的鹽為對農化有利的鹽；然而，本發明也包括不適合農化應用目的的鹽，例如對蜜蜂或魚有毒的鹽，以及使用於例如分離或純化自由態式 I 化合物或其農化上可接受鹽的鹽也包括在本範圍內。由於式 I 化合物的自由形態和鹽形態之間的關係密切，自由態化合物 I，或其鹽應被了解在本文中所代表的意義，適當的也分別包括其相對應的鹽和自由態化合物 I。同樣也適用於式 I 化合物的互變異構物和其鹽，一般在每一種情況下以自由態為佳。

除非另外定義，本文中所用的名詞均定義如下。

A 雜環基的基本環結構中的合適雜原子均為周期表的元素，可形成至少兩個共價鍵。

## 五、發明說明(4)

鹵素，本身為一取代基，也作為其它基和化合物的結構部份，例如鹵素烷基，鹵素烷基硫羰，鹵素烷氧基，鹵素環丙基，鹵素烯基，鹵素炔基，鹵素烯丙基氧基和鹵素烯丙基硫羰，其為氟，氯，溴或碘，其中以氟，氯或溴較佳，又以氟或氯次佳，又以氯最佳。

除非另外定義，含碳的基和化合物包含1到6個碳原子，較佳含1到3個碳原子，特別是1或2個碳原子。

環烷基為環丙基，環丁基，環戊基或環己基，較佳為環丙基。

烷基，本身為一基，也作為其它基和化合物的結構，例如苯基烷基，鹵素烷基，烷氧基，鹵素烷氧基，烷基硫羰和鹵素硫羰，在每一種情況下，乃考慮到特殊化合物或基所含碳原子數目，不是直鏈者，亦即是甲基，乙基，丙基，丁基，戊基或己基，支鏈者，例如異丙基，異丁基，二級丁基，三級丁基，異戊基，正戊基或異己基。

烯基，鹵素烯基，炔基和鹵素炔基為直鏈或支鏈，其在每一種情況下含有2個，較佳含一個不飽和碳-碳鍵。取代基的雙鍵或參鍵較佳係被至少一個飽和碳原子分離自化合物I的殘留部份。可提到的實例為烯丙基，甲烯丙基，丁-2-烯基，丁-3-烯基，烯丙基，丁-2-炔基和丁-3-炔基。

被鹵素取代的含碳基和化合物，例如鹵素烷基，鹵素烷氧基，鹵素烷基硫羰，鹵素環丙基，鹵素烯基，鹵素炔

## 五、發明說明 (5)

基，鹵素烯丙基氧基和鹵素烯丙基硫基，可為部份鹵化或過鹵化，以多鹵化情況，鹵素取代基可為相同或不同。鹵素烷基的實例中，本身為一基，也同時為其它基和化合物的結構部份，例如鹵素烷基硫基和鹵素烷基氧基，為甲基，其被氟，氯和／或溴單取代到參取代，例如  $\text{CH}_2\text{F}_2$  或  $\text{CF}_3$ ；乙基，其被氟，氯和／或溴單取代到五取代，例如  $\text{CH}_2\text{CF}_3$ ， $\text{CF}_2\text{CF}_3$ ， $\text{CF}_2\text{CCl}_3$ ， $\text{CF}_2\text{CHCl}_2$ ， $\text{CF}_2\text{CHF}_2$ ， $\text{CF}_2\text{CFCl}_2$ ， $\text{CF}_2\text{CHBr}_2$ ， $\text{CF}_2\text{CHClF}$ ， $\text{CF}_2\text{CHBrF}$  或  $\text{CClFCHClF}$ ；和丙基或異丙基，每個被氟，氯和／或溴單取代到七取代，例如  $\text{CH}_2\text{CHBrCH}_2\text{Br}$ ， $\text{CF}_2\text{CHF}_2$ ， $\text{CF}_3$  或  $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$ ；和丁基或其一異構物，每一個為單到九個氟，氯和／或溴取代，例如  $\text{CF}(\text{CF}_3)\text{CHF}_2$  和  $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$ 。鹵素烯基的實例為 2，2-二氟乙烯-1-基，2，2-二氯乙烯-1-基，2-氯丙-1-烯-3-基，2，3-二氯丙-1-烯-3-基和 2，3-二溴丙-1-烯-1-基。鹵炔基的實例為 2-氯丙-1-炔-3-基，2，3-二氯丙-1-炔-3-基和 2，3-二溴丙-1-炔-3-基。鹵環丙基的實例為 2-氯環丙基，2，2-二氟環丙基和 2，-氯-2-氟環丙基。鹵烯丙基氧基的實例為 2-氯丙-1-烯-3-基氧基，2，3-二氯丙-1-烯-3-基氧基和 2，

## 五、發明說明 (b)

3 - 二溴丙 - 1 - 烯 - 3 - 基氧基。鹵烯丙基硫鈹的實例為 2 - 氯丙 - 1 - 烯 - 3 - 基硫鈹，2, 3 - 氯丙 - 1 - 烯 - 3 - 基硫鈹和 2, 3 - 二溴丙 - 1 - 烯 - 3 - 基硫鈹。

苯基烷基中，一鍵合到化合物 I 殘留者的烷基被一苯基取代，在此情況下，烷基較佳為直鏈而苯基較佳被鍵合於高於烷基的  $\alpha$  - 位置之處，最佳在其  $\omega$  位置；實例為苄基，2 - 苯基乙基和 4 - 苯基丁基。

本發明中的較佳具體實施例為：

(1) 一式 I 化合物，其中

A 為一未取代或單取代到四取代的芳香系或非芳香系，單環或雙環雜環基，其中一到二個 A 取代基可選自鹵素 -  $C_1 - C_3$  烷基，環丙基，鹵素環丙基， $C_2 - C_3$  烯基， $C_2 - C_3$  炔基，鹵素 -  $C_2 - C_3$  烯基，鹵素 -  $C_2 - C_3$  炔基，鹵素 -  $C_1 - C_3$  烷氧基， $C_1 - C_3$  - 烷基硫鈹，鹵素 -  $C_1 - C_3$  硫鈹，烯丙基氧基，炔丙基氧基，烯丙基硫鈹，炔丙基硫鈹，鹵素烯丙基氧基，鹵素烯丙基硫鈹，氨基和硝基，一到四個 A 取代基可選自  $C_1 - C_3$  烷基， $C_1 - C_3$  烷氧基和鹵素；

R 為氫， $C_1 - C_6$  - 烷基， $C_3 - C_6$  環烷基， $C_2 - C_6$  烯基或  $C_2 - C_6$  炔基；和

X 為  $N - NO_2$  或  $N - CN$ ；

(2) 一式 I 化合物，其中 A 的基本環結構為 5 或 6 個環員所

### 五、發明說明 ( 7 )

構成的環，還融接一具 5 或 6 環員的環，特別是一具 5 或較佳具 6 環員的環；

(3) 一式 I 化合物，其中 A 的基本環結構為不飽和，特別含一雙鍵，或較佳 2 到 4 個雙鍵，較佳為共軛雙鍵，其中較佳基本環結構含 2 個雙鍵，較佳為共軛雙鍵，特別是其中基本環結構含芳香系特性；

(4) 一式 I 化合物，其中 A 的基本環結構含 1 到多達 4 個，特別是 1 到多達 3 個，更特別是 1 或 2 個雜原子，特佳為 1 個雜原子；

(5) 一式 I 化合物，其中 A 的基本環結構係選自以下的基本環結構

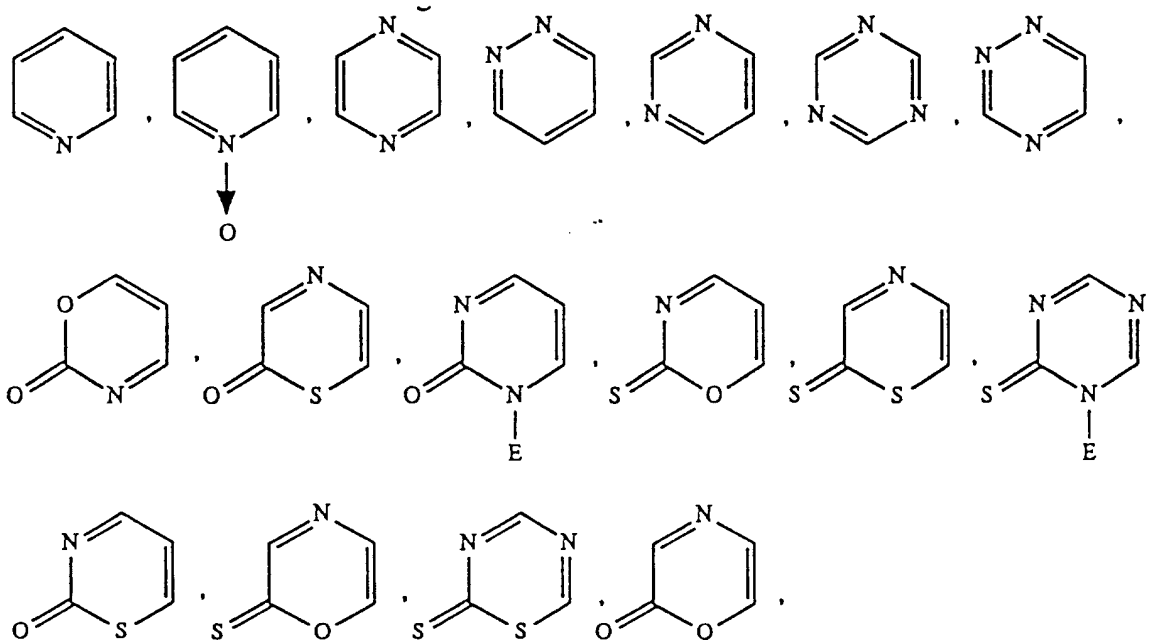
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製



五、發明說明 ( 8 )

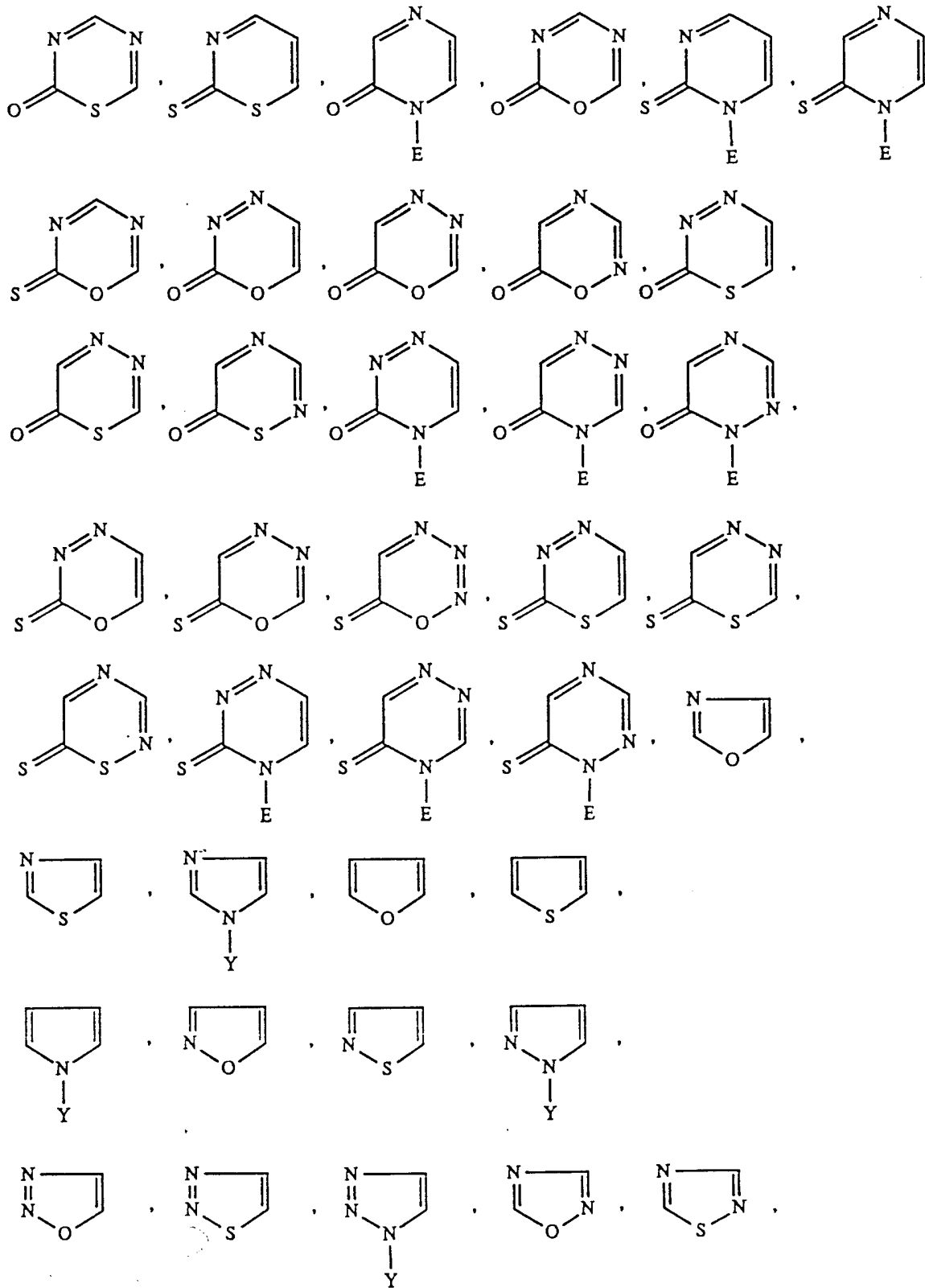


(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明(9)

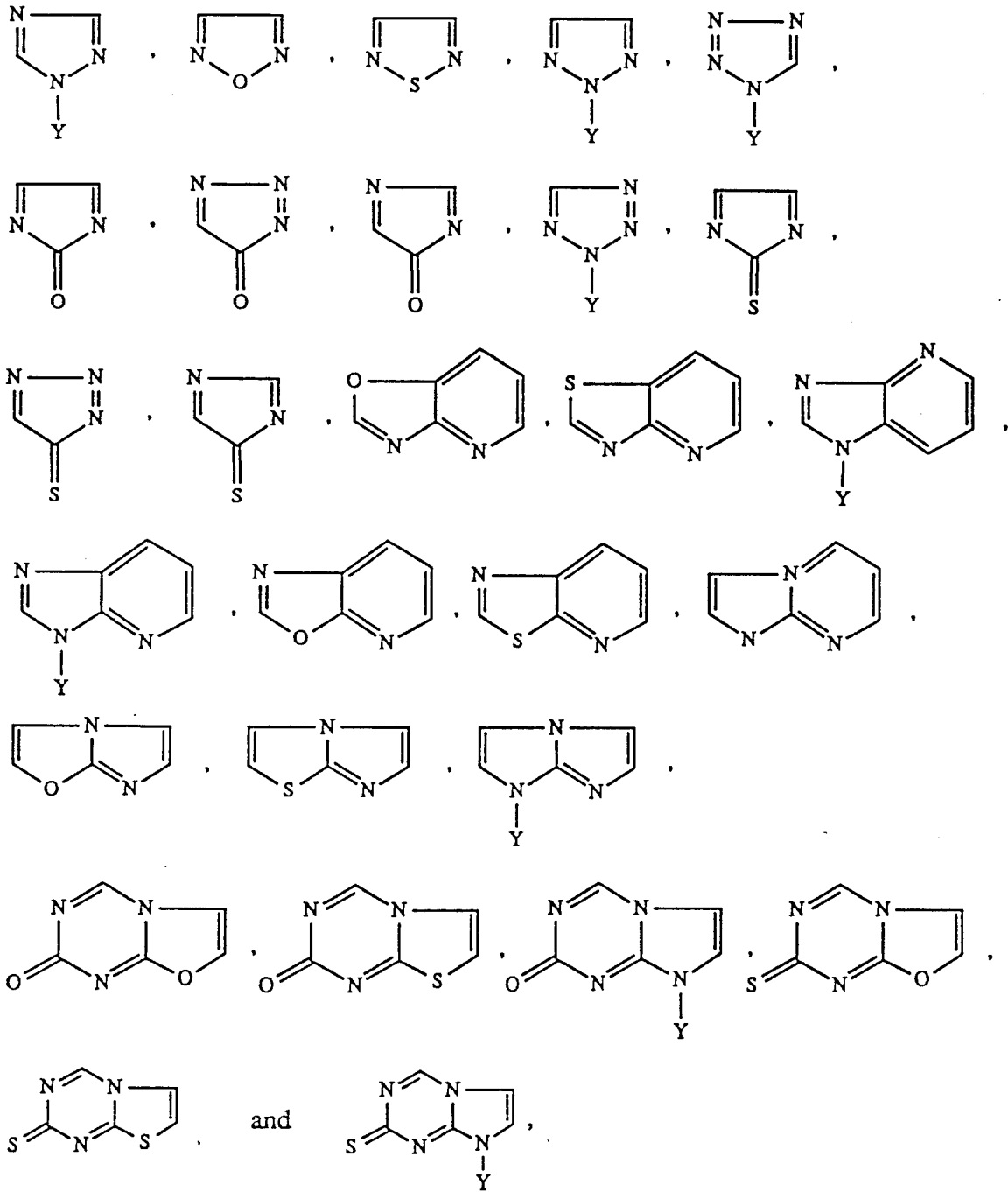


(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (10)



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

## 五、發明說明 (11)

其中 E 在每種情況為  $C_1 - C_3$  烷基，Y 均為氫， $C_1 - C_3$  烷基或環丙基，E 和 Y 分別不被視為 A 取代基，但被視為 A 基本環結構的一部份；

(6) 一式 I 化合物，其中 A 的基本環結構含 1, 2 或 3 個雜原子，其係選自氧硫和氮，其中基本環結構中不超過 1 個雜原子為氧原子，而基本環結構中不超過 1 個雜原子為硫原子，

特別是其中基本環結構含 1, 2 或 3 個雜原子，其係選自氧硫和氮，其中基本環結構中不超過 1 個雜原子為氧原子或硫原子，較佳至少一個氮原子；

(7) 一式 I 化合物，其中 A 經由一基本環結構上的碳原子被鍵合到式 I 化合物的殘留部份上；

(8) 一式 I 化合物，其中 A 未取代，或被包括鹵素， $C_1 - C_3$  烷基，鹵素 -  $C_1 - C_3$  烷基， $C_1 - C_3$  烷氧基和鹵素 -  $C_1 - C_3$  烷氧基單或二取代，

較佳其中 A 未取代，或被包括鹵素， $C_1 - C_3$  烷基單或二取代；

(9) 一式 I 化合物，其中 A 的基本環結構為吡啶基，1-氧撐吡啶並或噻唑基，

其中較佳一 A 基本環為吡啶 - 3 - 基，1-氧撐 - 3 - 吡啶並或噻唑 - 5 - 基，

特別的是，其中 A 的基本環構為吡啶 - 3 - 基，2-鹵吡啶 - 5 - 基，2, 3-二鹵吡啶 - 5 - 基，2 -  $C_1 - C$

## 五、發明說明 (12)

3 烷基吡啶 - 5 - 基，1 - 氧撐 - 3 - 吡啶並，2 - 鹵 - 1 - 氧撐 - 5 - 吡啶並，2, 3 - 二鹵 - 1 - 氧撐 - 5 - 吡啶並或 2 - 鹵噻唑 - 5 - 基，

特別的是，其中 A 為吡啶 - 3 - 基，2 - 鹵吡啶 - 5 - 基，2, 3 - 二鹵吡啶 - 5 - 基，2 - C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> 烷基吡啶 - 5 - 基，1 - 氧撐 - 3 - 吡啶並，2 - 鹵 - 1 - 氧撐 - 5 - 吡啶並或 2 - 鹵噻唑 - 5 - 基，

較佳者，其中 A 為 2 - 氯吡啶 - 5 - 基，2 - 二甲基吡啶 - 5 - 基，1 - 氧撐 - 3 - 吡啶並，2 - 氯 - 1 - 氧撐 - 5 - 吡啶並，2, 3 - 二氯 - 1 - 氧撐 - 5 - 吡啶並或 2 - 氯噻唑 - 5 - 基，

特別的是，其中 A 為吡啶 - 3 - 基，2 - 氯吡啶 - 5 - 基，2 - 氯 - 1 - 氧撐 - 5 - 吡啶並或 2 - 氯噻唑 - 5 - 基，

特別是其中的 A 為 2 - 氯吡啶 - 5 - 基，或較佳為 2 - 氯噻唑 - 5 - 基；

(10) 式 I 化合物中的 R 為 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 烷基，苯基 - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 烷基，C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> 環烷基，C<sub>3</sub> - C<sub>4</sub> 烯基或 C<sub>3</sub> - C<sub>4</sub> 炔基，

較佳為 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 烷基，C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> 環烷基，C<sub>3</sub> - C<sub>4</sub> 烯基或 C<sub>3</sub> - C<sub>4</sub> 炔基，

特別是 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 烷基，苯基 - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 烷基，C<sub>3</sub> - C<sub>4</sub> 烯基或 C<sub>3</sub> - C<sub>4</sub> 炔基，

## 五、發明說明(17)

更特別是 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 烷基，又以甲基較佳；

(11) 一種式 I 化合物，其中 X 為 N - NO<sub>2</sub>；

(12) 一式 I 化合物，其中 A 的基本環結構為吡啶基，1-氧撐吡啶並或噻唑基，其經由一基本環結構鍵合到式 I 化合物的殘留部份，且 A 未取代，或被包括鹵素和 C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> 烷基單或二取代，R 為 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 烷基，苯基 - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 烷基，C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> 環烷基，C<sub>3</sub> - C<sub>4</sub> 烯基或 C<sub>3</sub> - C<sub>4</sub> 炔基和 X 為 N - NO<sub>2</sub> 或 N - CN；

(13) 一式 I 化合物中 A 為 2-氯吡啶-5-基，2-甲基吡啶-5-基，1-氧撐-3-吡啶並，2-氯-1-氧撐-5-吡啶並，2,3-二氯-1-氧撐-5-吡啶並或 2-氯噻唑-5-基，R 為 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 烷基和 X 為 N - NO<sub>2</sub>；

(14) 一式 I 化合物中 A 為 2-氯吡啶-5-基或 2-氯噻唑-5-基，R 為 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 烷基和 X 為 N - NO<sub>2</sub>；

本發明範圍中特佳的式 I 化合物為實例 H3 和 H4 所述者。

本發明範圍中特佳的化合物為

(a) 5 - (2-氯吡啶-5-基甲基) - 3-甲基-4-硝基亞胺基過氫-1,3,5-噁二嗪，

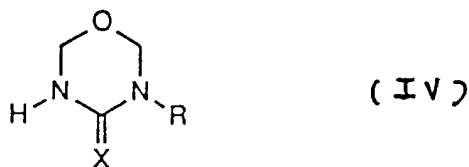
(b) 5 - (2-氯噻唑-5-基甲基) - 3-甲基-4-硝基亞胺基過氫-1,3,5-噁二嗪，



## 五、發明說明 (15)

中 R 定義同式 I，氫除外，Y 為一離去基，或

(c) 較佳在一鹼存在下使一下式化合物



其中 R 和 X 定義同式 I，或其互變異構物和 / 或其鹽，與一下式化合物反應



以上化合物為已知或可製備於類似相對應已知化合物，其中 A 定義同式 I，Y 為一離去基，或適當地，與其互變異構物和 / 或其鹽反應，

和 / 或，視需要，將式 I 化合物或其互變異構物（在每一種情況之下為自由形態或鹽形態，係製備自本發明或不同方法）轉變為不同的式 I 化合物或其互變異構物，分離本發明方法所製得的異構物混合物，而分離出所希望得到的異構物和 / 或製備自本發明方法的一自由態式 I 化合物或其一互變異構物，被轉化成一鹽，或一製備自本發明方法的式 I 化合物或其一互變異構物的鹽，被轉化成自由態式 I 化合物或其一互變異構物，或轉化成不同的鹽。

以上所述有關互變異構物和式 I 化合物的鹽也適用於本文其它部份所指起始材料的互變異構物和鹽。

本文中所述反應係在一本身已知方式中進行，例如在沒有溶劑，或者，一般而言在一合適溶劑或稀釋劑或其混



## 五、發明說明 (16)

合物的存在之下進行，若有必要，該操作是在一邊攪拌下於室溫或加熱中進行，例如在約  $-80^{\circ}\text{C}$  到反應媒介的沸點，較佳從約  $-20^{\circ}\text{C}$  到約  $+150^{\circ}\text{C}$ ，若有需要，在一密閉反應器，在加壓中，於一惰性大氣和 / 或在無水條件下進行。特別有利的反應條件可於實例中發現。

本文中所指的用於製備式 I 化合物，以及適當地製備其互變異構物（在每一種情況下為自由態或鹽形態）的起始材料為已知的，或者可依已知方法加以製備，例如依照以下實例加以製備。

## 變數 (a)

合適加速反應的鹼為鹼金屬或鹼土金屬的氫氧化物，氫化物，醯胺，烷醯酸鹽，酯酸鹽，碳酸鹽，二烷基醯胺或烷基甲矽醯胺；烷基胺，烷撐二胺，自由態或 N-取代基烷基化的不飽和或飽和的環烷基胺，鹼雜環，氫氧化銨和碳環胺。可能述及的實例包括氫氧化鈉，氫化鈉，醯胺鈉，甲醇酸鈉，酯酸鈉，碳酸鈉，特-醇丁酸鉀，碳酸鉀，二異丙基醯胺鋰，雙(三甲基矽烷基)醯胺鉀，氫化鈣，三乙胺，三乙撐二胺，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，苄基三甲基氫氧化銨以及 1,5-二氮雜雙環[5.4.0]十一-5-烯 (DBU)。

便利反應進行的合適酸觸媒為，例如上述使用一觸媒

## 五、發明說明 (17)

數量適合與式 I 化合物形成酸加成鹽的酸。

反應劑之間可以互相反應，換言之，在沒有添加溶劑或稀釋劑，例如在熔融物中進行。然而，一般而言，添加一惰性溶劑或稀釋劑或其混合物是有利的。會提到的此類溶劑和稀釋劑的實例為芳香系，脂肪系和非環系烴和鹵化烴，例如苯，甲苯，二甲苯，氯苯，溴苯，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；酯，例如醋酸乙酯，三級-丁基甲基醚，乙二醇單甲基醚，乙二醇二乙基醇，四氫呋喃或二噁烷；酮，例如丙酮，甲基乙基酮或甲基異丁基酮；醇，例如甲醇，乙醇，丙醇，丁醇，乙二醇或甘油；醯胺，例如 N，N-二甲基甲醯胺，N，N-二甲基乙醯胺，N-甲基吡咯烷酮或六甲基磷酸三醯胺；腓，例如乙腓；和亞礪如二甲基亞礪。如果反應是在一鹼中進行，則可以使用過量的鹼，如三乙基胺，吡啶，N-甲基嗎啉或 N，N-二乙基苯胺，以作為溶劑或稀釋劑。如果反應是在一酸觸媒中進行，則可以使用過量的酸，例如有機強酸，如未取代或取代者，如鹵取代，C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷酸，例如甲酸，醋酸或丙酸，以作為溶劑或稀釋劑。

反應較有利於約 0 °C 到約 + 180 °C 進行，較佳於 + 10 °C 到約 + 130 °C 進行，在大多情況下是在室溫到反應混合物的回流溫度下進行的。

視需要，反應期間所形成的水可在水分離器輔助下藉

## 五、發明說明 (13)

由共沸蒸餾或添加一合適分子篩被脫除。

變數 (b)

式 I I I 化合物中的合適離去基 Y 例如為羥基， $C_1 - C_8$  烷氧基，鹵 -  $C_1 - C_8$  烷氧基， $C_1 - C_8$  烷醯氧基，硫醇基， $C_1 - C_8$  烷基硫羰，鹵 -  $C_1 - C_8$  烷基硫羰， $C_1 - C_8$  烷磺醯氧基，鹵 -  $C_1 - C_8$  烷磺醯氧基，苯磺醯基氧基，甲苯磺醯氧基和鹵素。

便利脫除 YH 的合適鹼例如為變數 (a) 所給的型態。

反應劑之間可以互相反應，換言之，在沒有添加溶劑或稀釋劑，例如在熔融物中進行。然而，一般而言，添加一惰性溶劑或稀釋劑或其混合物是有利的。會提到的此類溶劑和稀釋劑的實例為芳香系，脂肪系和非環系烴和鹵化烴，例如苯，甲苯，二甲苯，氯苯，溴苯，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；酯，例如醋酸乙酯，三級 - 丁基甲基醚，乙二醇單甲基醚，乙二醇二乙基醇，四氫呋喃或二噁烷；酮，例如丙酮，甲基乙基酮或甲基異丁基酮；醇，例如甲醇，乙醇，丙醇，丁醇，乙二醇或甘油；醯胺，例如 N, N - 二甲基甲醯胺，N, N - 二甲基乙醯胺，N - 甲基吡咯烷酮或六甲基磷酸三醯胺；腈，例如乙腈；和亞礪如二甲基亞礪。如果反應是在一鹼中進行，則可以使用過量的鹼，如三乙基胺，吡啶，N - 甲基嗎啉或 N, N - 二乙基苯胺，以作為溶

## 五、發明說明 (19)

劑或稀釋劑。

反應較有利於約  $0^{\circ}\text{C}$  到約  $+180^{\circ}\text{C}$  進行，較佳於  $+10^{\circ}\text{C}$  到約  $+130^{\circ}\text{C}$  進行，在大多情況下是在室溫到反應混合物的回流溫度下進行的。

變數 (c)

化合物 V 中合適的離去基例如為變數 (b) 所給的型態。

便利脫除 YH 的合適鹼例如為變數 (a) 所給的型態。

反應劑可互相之間反應，如沒有添加溶劑或稀釋劑，例如在一熔融態。然而，在大部份情況下，添加一惰性溶劑或稀釋劑或其混合物較有利。合適的溶劑或稀釋劑例如為變數 (b) 所述者。

反應較有利於約  $-20^{\circ}\text{C}$  到約  $+180^{\circ}\text{C}$  進行，較佳於  $+10^{\circ}\text{C}$  到約  $+100^{\circ}\text{C}$  進行，在大多情況下是在使用溶劑的回流溫度下進行的。

式 I V 化合物和其互變異構物和 / 或其鹽 (在每一種情況下為自由形態或鹽形態) 在方法變數 (c) 作為加成物，其為新穎，且構成本發明的一部份。本發明範圍中特佳的化合物為實例 H 1 和 H 2 所述的式 I V 化合物和其互變異構物。

(d) 使一下式化合物



## 五、發明說明 (7/)

態式 I 化合物或其互變異構物，或轉化成不同的鹽。

製備自本發明或不同方法的化合物 I 或 I V 可被已知的方法轉變成不同的化合物 I 或 I V，其係藉著本發明的方式不同取代基取代起始化合物 I 或 I V 的一或多個取代基。

若式 I 化合物有一未取代基 A，例如取代基可被導入 A 基，或者式 I 化合物有一取代基 A，例如 A 取代基可被其它取代基替代。

在該轉化過程中，依所選擇的起始材料和適合特殊用途的反應條件而定，可能在單一反應步驟中代用另一本發明的取代基取代一取代基，或者可能在相同的反應步驟當中用另一本發明的取代基取代多個取代基。

式 I 或式 I V 化合物的鹽可用一已知的方式加以製備，例如，式 I 或式 I V 化合物的酸加成鹽可用一合適的酸或一合適的離子交換試劑。

式 I 或式 I V 化合物的鹽可用一習用的方式被轉化成式 I 或式 I V 的自由態化合物；例如，酸加成鹽可經由一合適的鹼試劑或一合適的離子交換試劑加以處理而被轉化，或者鹼加成鹽經由一合適的酸試劑或一合適的離子交換試劑加以處理而被轉化。

式 I 或式 I V 化合物的鹽可用一習用的方式被轉化成式 I 或式 I V 的其它化合物的鹽；例如，酸加成鹽可被轉化成其它的酸加成鹽，其係藉著用一合適的金屬鹽如鈉，

## 五、發明說明 (✓)

銀或銀鹽處理一無機酸的鹽如一氫氧化物，或者在一合適溶劑中用醋酸銀處理一酸的鹽，形成無機鹽如氯化銀，因為溶解，可從反應混合物被去除。

依照程序和反應條件而定，具備形成鹽性質的式 I 或式 I V 化合物可被製成自由態或鹽的形態。

式 I 或式 I V 化合物，以及適當地其互變異構物（在每一種情況下以自由態或鹽形態）可以其中一種可能的異構物或其混合物存在，例如以純異構物形式存在，如對映體和 / 或非對映異構物，或為異構物混合物，如對映異構物混合物，例如消旋物，非對映異構物混合物或消旋物混合物，依非對稱碳原子的數目和絕對和相對組態而定；本發明係關於純異構物和所有可能的異構物混合物，在本文前後文應該有相對應的了解，即使每個例子中未特別詳述其立體化學構造。

依照該方法（依選擇起始物質和程序而定）或其它途徑所製備的式 I 化合物，適當地以及互變異構物（每一種情況下以自由態或鹽形態）的非對映異構物混合物和消旋物混合物可以已知的方法在化合物物化性質差異的基礎上加以分離，得到純非對映異構物或消旋物，例如由分餾結晶，蒸餾和 / 或色層分析術。

可據此得到的對映異構物混合物，例如消旋物，可被已知方法予以分離，以得到光學對映物，例如藉著再結晶自一光學活性溶劑中，藉色層分析術於旋光吸附劑上例如

## 五、發明說明 (2)

高壓液相色層分析 (HPLC) 於乙醯纖維素上 (藉助於合適微生物), 用特殊無活動性酵素予以分解, 經由形成內包物化合物, 例如利用旋光冠醚, 其中只有一非對映異構物被錯合, 或者藉由轉成非對映異構物鹽, 例如藉由一鹼末端產物消旋物與一光學活性酸, 例如一羧酸如樟腦酸, 酒石酸或馬來酸, 或一磺酸, 例如樟腦磺酸, 並分離所得到的非對映異構物混合物, 例如以部分分餾利用其溶解度的差異, 分離出可藉由一合適的如鹼性試劑作用從中取得所希望獲得的對映異構物。

純非對映異構物或對映異構物可依照本發明而得到, 不僅由分離相對應異構物混合物, 而且由泛知的非對映選擇或對異選擇合成方法, 例如以本發明的方法採用立體化學合適者的反應物進行。

每個實例中分離或合成生物學上更具活性的異構物, 例如對映異構物, 或異構物混合物, 例如對映異構物混合物, 如果個別成份在生物活性上有差異的話。

式 I 或式 IV 化合物 (每一種情況下以自由態或鹽形態) 的非對映異構物混合物和消旋也可以其水合物和 / 或包括其它溶劑形式被製備, 例如可被結晶固態形式的化合物所使用者。

本發明關於所有方法的實施例, 實施例中以方法中任何所要的步驟所製得的化合物作為起始物質或者中間體, 其中所有或部份不見了的步驟被進行, 或者其中一起始物



## 五、發明說明 (4)

質以其一衍生物或鹽和 / 或消旋物或對映物的形式被使用，特別是在反應條件下形成者。

本發明的方法較佳使用會產生式 I 化合物的起始物質和中間體（在每一種情況下為自由形態或鹽形態）或其鹽，該方法和本文開頭已有所述，此處最有價值。

特別的是，本發明關於製備方法如實例 H 1 到 H 4 所述。

本發明更關於新穎的起始材料和中間體（在每一種情況下為自由形態或鹽形態），據此依本發明來製備式 I 化合物或其鹽，其製備方法和作為製備化合物的起始材料和中間體之用途；特別是在化合物 I V 的應用。

本發明的式 I 化合物殺虫領域是活性成份，其其殺虫範圍很廣，且很有用，即使不常使用情況下也能達到預防和 / 或治療的效果，在此同時，溫血生物，魚和植物卻能夠忍受，本發明式 I 化合物一般敏感但也具有抗性的害虫的所有或個別成長階段都具有活性。其活性作用可能變得明顯，例如立刻或只在經過某段時間（例如在蛻變期間）之後破壞害虫或是減少產卵和 / 或孵出速率。本發明的式 I 化合物的優良殺虫活性表現於其對上述害虫至少達到 50 - 60 % 的破壞率（死亡率）。



修正  
83年7月18日  
補充

五、發明說明( )

直翅目者，例如非蟻屬，小蟻，環姑屬，馬得拉蜚蟻，飛蝗屬，大蟻屬和炸蝻屬；

等翅目者，例如白蟻屬；  
嘴虫目者，例如象書虱屬；

虱目者，例如 Haematopinus 屬和長頸虱屬，多虱屬，慶綿蚜屬和根瘤蚜屬；

食毛目者，例如 Damalinaea 屬和羽虱屬；

纓翅目者，例如薊馬屬，薊馬屬，綠薊馬屬，棕薊馬屬，棉薊馬屬和橙薊馬；

異翅目者，例如葉蜂屬，Distantiella theobroma, 紅椿屬，Euchistus屬，盾椿屬，綠椿屬，綠椿屬，網椿屬，Rhodnius 屬，Sahlbergella singularis, 稻椿屬和濕椿屬；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製



## 五、發明說明 (28)

本發明的活性成份可以控制上述型態的害虫，也就是將其包起來或加以消滅，該害虫會生現在植物上，特別是在有價值的農業，園藝和森林植物和裝飾品用植物上，或在部份的此類植物上，如水果，花，樹葉，莖，球根或根，和在某些情況下，甚至新形成的植物，都可以受保護免於病虫害。

合適作為目標的農作物為，特別是，穀類，如麥，大麥，裸麥，燕麥，米，玉米或高粱；甜菜類，如甜菜或草料甜菜；水果，如梨果，核果和軟果，如蘋果，梨，李子，桃子，杏仁，櫻桃或莓，如草莓，藍莓或黑莓；豆科植物，例如豆，馬尾藻，豌豆或大豆；油農作物，例如油菜籽，芥末，罌粟，橄欖，向日葵，椰子，蓖爾油，可可，或落花生；葫蘆類，例如南瓜，胡瓜或西瓜；纖維植物，例如綿，亞麻，大麻或黃麻；柑橘類植物，例如橘子，檸檬，葡萄柚或橘柑；蔬菜，例如菠菜，萵苣，蘆筍，甘藍，胡蘿蔔，葱，蕃茄，馬鈴薯，或胡椒；Lauraceae，例如等梨，肉桂或樟腦；和烟草，果核，咖啡，茄子，甘蔗，茶，胡椒，葡萄，蛇麻草，Musaceae，乳膠植物和裝飾性植物。

本發明的活性成份特別適合控制蔬菜，玉米，水果，米和大豆農作物中的 *Aphis craccivora*, *Bemisia tabaci*,

## 五、發明說明 (&gt;9)

*Diabrotica balteata*, *Heliothis virescens*, *Myzue persicae*, *Nephotettix cinciticeps* 和 *Nilaparvata lugens*

本發明活性成份的其它應用領域為保護儲存產物和物質，以及在衛生保健方面，特別是在保護家養動物和生產的牲畜免受上述害虫之害。

本發明也關於殺虫劑，例如為可乳化濃縮物，懸浮濃液，直接可噴式或可稀釋溶液，直接噴灑或可稀釋乳化液，可分散膏，可濕潤粉末，可溶粉末，可分散粉，粉塵和顆粒，也有含於聚合物質的膠囊。應用方法舉凡噴塗，噴霧，塗粉，分散或澆注以及組成物均被選定以符合目的和一般環境需要。

在這些組成物當中，活性成份被作為純的活性成份，例如為一特定粒徑的固體活性成份，或者與至少一種傳統技藝所用助劑一起使用，例如延展劑，如溶劑或固體載體，或例如表面活性化合物（界面活性劑）。

以下為合適的溶劑：芳香系烴，較佳為烷基苯的 C<sub>8</sub> 到 C<sub>12</sub> 分餾物，如二甲苯混合物或烷基酸化萘或四氫萘，脂肪系環脂肪系烴，例如環己烷，石蠟或四氫萘，醇，例如乙醇，丙醇或丁醇，二醇以及其醚和酯，例如丙二醇，二丙二醇醚，乙二醇，乙二醇單甲基醚或乙二醇單乙基醚，酮，例如環己酮，異佛爾酮或二丙酮醇，極性強溶劑，例如 N-甲基-2-吡咯烷酮，二甲基亞砷或 N, N-

五、發明說明 ( $\lambda^0$ )

二甲基甲醯胺，水和環氧化或不環氧化菜油，蓖麻油，椰子油或大豆油；矽酮油等可使用。

合適例如粉塵和分散粉塵使用的固體載體一般為磨粹天然礦物油，如碳酸鈣，滑石，高嶺土，蒙脫土或 attapulgate。為了改善物理性質，也可能添加高分散性二氧化矽或高分散性吸收性聚合物。可能供顆粒使用的顆粒吸附載體為孔性型態如浮石，磨粹磚，海泡石或膨潤土或非吸著性載體物質，如碳酸鈣或沙。再者，無機或有機的大量顆粒物質也可供使用，特別是白雲石或粉粹的植物殘留物。

合適的界面活性劑化合物為非離子，陽離子和 / 或陰離子界面活性劑混合物，其具備優良乳化性，分散性和濕潤性質，依本發明被調配的活性成份而定特性而定。以下的界面活性劑只為實例而已；特殊文獻描述許多傳統技藝所用配方和合適界面活性劑。

合適的非離子界面活性劑主要為脂肪系或環脂肪系醇，飽和或不飽和脂肪酸和烷基酚的聚二醇醚衍生物，其（脂肪系）自由基可含有 3 到 30 個二醇醚基和 8 到 20 個碳原子以及烷基酚的烷基自由基中含 6 到 18 個碳原子。同時合適使用者為水溶性聚氧化乙烯加成物與聚丙二醇，乙烯二胺基聚二醇和烷基聚丙二醇，其烷基鏈含 1 到 10 個碳原子和含 20 到 250 個乙二醇醚基和 10 到 100 個丙二醇醚基。一般而言，所提到的化合物每個丙二醇含 1

## 五、發明說明 (71)

到 5 個碳乙二醇單位。非離子界面活性劑的實例包括壬基酚聚乙氧基乙醇，蓖麻油聚二醇醚，聚氧化丙烯／聚氧化乙烯加成物，三丁基苯氧基聚乙氧基乙醇，聚乙二醇和辛基苯氧基聚乙氧基乙醇。其它合適的物質為聚氧乙烯山梨糖醇酐的脂肪酸酯，例如聚氧基乙烯山梨糖醇酐三油酸酯。

陽離子界面活性主要為季銨鹽，其含有至少一種 8 到 22 個碳原子的烷基自由基作為取代基，其具備低級鹵化或自由態烷基，苄基或低級羥基烷基自由基，作為進一步的取代基。該鹽較佳以鹵化物，甲基硫酸鹽或乙基硫酸鹽形式存在，例如硬脂醯基三甲基氯化銨或苄基二（2-乙基）溴化銨。

合適的陰離子界面活性劑可為所謂的水溶性皂或水溶性合成界面活性化合物。適合的皂為鹼金屬鹽，鹼土金屬鹽或取代或未取代的高級脂肪酸（ $C_{10} - C_{22}$ ）銨鹽，例如油酸或硬脂酸的鈉鹽或鉀鹽，或者可得到的脂肪酸天然混合物，例如從椰子油或妥爾油；必須一提的還有脂肪酸甲基牛磺酸鹽。然而，所謂的合成界面活性劑更常被使用者，特別是脂肪磺酸鹽，脂肪硫酸鹽，磺化苯並咪唑衍生物或烷基芳基磺酸鹽。脂肪磺酸鹽或脂肪硫酸鹽一般以鹼金屬鹽，鹼土金屬鹽或取代或未取代銨鹽，以及一般而言含 8 到 22 個碳原子的烷基，烷基也包括醯基自由基的烷基部份；實例為木質磺酸，十二烷硫酸酯或製備自天



## 五、發明說明 (27)

然脂肪酸的脂肪醇硫酸鹽混合物的鈉鹽或鈣鹽。此放族群也包括硫酸酯鹽和脂肪醇／環氧乙烷磺酸加成物。磺化苯並咪唑衍生物較佳含 2 個硫基和一約含 8 到 22 個碳原子的脂肪酸自由基。烷基芳基磺酸鹽的實例為十二烷基磺酸，二丁基萘磺酸或萘磺酸／甲醛縮合產物的鈉鹽，鈣鹽或三乙醇銨。其它合適的化合物為相對應的磷酸鹽，例如對-壬基酚／(4-14)環氧乙烷加成物或磷脂的磷酸酯鹽。

應該了解以上所述界面活性劑僅為實例而已；許多其它被應用於此技藝配方的界面活性劑以及適合本發明使用者會記載在專家文獻中。

一般而言，殺虫劑組成物包含 0.1 到 99%，特別是 0.1 到 95% 活性成份 I 或此成份與其它殺虫劑和／或殺恙虫劑的混合物，特別是 5 到 99.9% 的固體或液體佐劑，一般為 0 到 25%，特別是 0.1 到 20% 的製備物為界面活性劑（每個實例的%為重量百分比）。雖然最好是採用濃縮組成物作為商品，最終使用者一般則使用較低濃度活性成份的稀釋組成物。

較佳配方特別為以下組成物（%為重量百分比）：

可乳化濃縮物

活性成份： 1 到 90%，較佳 5 到 20%

界面活性劑： 1 到 30%，較佳 10 到 20%

液體載體： 5 到 94%，較佳 70 到 85%

## 五、發明說明 (λλ)

## 粉塵

活性成份： 0.1 到 10%，較佳 0.1 到 1%

固體載體： 99.9 到 90%，較佳 99.9 到 99%

## 懸浮濃縮物

活性成份： 5 到 75%，較佳 10 到 50%

水： 94 到 24%，較佳 88 到 30%

界面活性劑： 1 到 40%，較佳 2 到 30%

## 可濕潤粉末

活性成份： 0.5 到 90%，較佳 1 到 80%

界面活性劑： 0.5 到 20%，較佳 1 到 15%

固體載體： 5 到 95%，較佳 15 到 90%

## 顆粒

活性成份： 0.5 到 30%，較佳 3 到 15%

固體載體： 99.5 到 70%，較佳 97 到 85%

本發明組成物活性包括藉著添加其它殺虫劑和/或殺恙虫劑而使其能夠被實質地擴展並配合各種環境的使用。合適的添加代表如以下各類的活性成份：有機磷化合物，硝基酚和其衍生物，甲米，脲，氨基甲酸酯，除虫菊，氯化煙和桿菌 *thuringiensis* 製備物。本發明組成也可包括固體或液體佐劑，例如安定劑如環氧化或未環氧化植物油（例如環氧椰子油，菜子油或大豆油），消泡劑，例如矽酮油，防腐劑，粘度調整劑，結合劑和/或增粘性，以及肥

## 五、發明說明 (24)

料或其它活性成份以達到特殊的效果，例如殺滿虫劑，殺細菌劑，殺黴菌劑，殺線虫劑，殺軟虫劑和除草劑。

本發明組成物係製備於已知方式，例如在沒有助劑之下，藉由研磨，篩選和／或壓縮一固體活性劑，或活性成份混合物，例如得到一某種粒徑者，以及在至少一種助劑之下，例如徹底混合助劑和／或研磨活性成份，或者成份混合物。本發明也關於這些製備本發明組成物的方法，以及化合物在製備組成物方面的應用。

本發明更關於組成物的應用方法，也就是控制上述型態害虫的方法，例如噴塗，噴霧，塗粉，分散或澆注以及組成物均被選定以符合目的和一般環境需要，以及組成物在控制上述害虫的使用。濃度速率特性介於0.1到1000 ppm，最好為0.1到500 ppm。通常，應用比率為每畝1到1000克的活性成份，最好是25到500克／畝。

在保護農作物領域的一較佳應用方法是在植物樹葉（樹葉應用）上，其使頻率和速率依受特別害虫感染的危險程度而定。然而，活性成份也可以經由根部系統（系統作用）抵達植物，其係藉著液體組成物將植物所在地濕潤或著將固體形態的活性成份加入植物所在地，例如加入土壤中，例如以顆粒形式（土壤應用）。在水稻方面，此種顆粒可被計量加入滿水的水稻田。

本發明組成物也適合保護植物繁殖材料，例如種子，

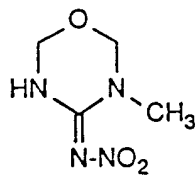
## 五、發明說明 (續)

如水果，或果核，或者植物移植小枝，以對抗害虫。該繁殖材料可在種植例如播種之前先對種子施予組成物的處理。或者，本發明的活性成份可用浸漬核果於液體組成物或用一固體組成物塗佈方式投予種子核果（塗佈）。再或者，也可以在種植繁殖材料之前將組成物投予種植地點，例如可在播種期間投予。本發明更關於處理繁殖材料的方法以及經過此種處理的植物繁殖材料。

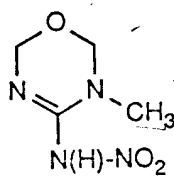
以下的實例旨在進一步說明本發明，並不構成對本發明的限制。溫度為攝氏。

## 製備實例

實例 H 1 : 3 - 甲基 - 4 - 硝基亞胺過氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪



或 3 - 甲基 - 4 - 硝基胺基 - 1, 2, 3, 6 - 四氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪



## 五、發明說明 (→b)

30.5 克的仲甲醛在室溫下被加入 20 克 N - 甲基 - N' - 硝基胍，17 克三乙基胺，100 毫升二噁烷和 100 毫升甲基的混合物中，該混合物被回流 16 小時，接著在真空下蒸發。殘留物被色層分析 [矽膠] 純化；二氯甲烷 / 甲醇 (95 : 5)，得到標題化合物，熔點為 137 - 139 °C。

實例 H 2：用類似於實例 H 1 所述方法，可製備以下的化合物：

3 - 乙基 - 4 - 硝基亞胺過氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪或  
3 - 乙基 - 4 - 硝基胺基 - 1, 2, 3, 6 - 四氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪，

4 - 硝基亞胺 - 3 - 丙基 - 過氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪或  
4 - 硝基胺基 - 3 - 丙基 - 1, 2, 3, 6 - 四氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪 (樹脂)，

3 - 丁基 - 4 - 硝基亞胺 - 過氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪或  
3 - 丁基 - 4 - 硝基胺基 - 1, 2, 3, 6 - 四氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪 (熔點 80 - 82 °C)，

3 - 環丙基 - 4 - 硝基亞胺過氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪或

## 五、發明說明 (7)

3 - 環丙基 - 4 - 硝基胺基 - 1, 2, 3, 6 - 四氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪,

3 - 烯丙基 - 4 - 硝基亞胺過氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪 或  
3 - 烯丙基 - 4 - 硝基胺基 - 1, 2, 3, 6 - 四氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪 (樹脂),

4 - 硝基亞胺 - 3 - 丙炔基 - 過氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪 或  
4 - 硝基亞胺 - 3 - 炔丙基 - 1, 2, 3, 6 - 四氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪 (熔點 102 - 104 °C),

4 - 氰基亞胺 - 3 - 甲基 - 過氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪 或  
4 - 氰基亞胺 - 3 - 甲基 - 1, 2, 3, 6 - 四氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪 (熔點 121 - 122 °C),

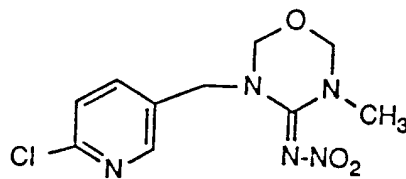
4 - 氰亞胺 - 3 - 乙基 - 過氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪 或  
4 - 氰亞胺 - 3 - 乙基 - 1, 2, 3, 6 - 四氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪,

4 - 氰亞胺 - 3 - 環丙基 - 過氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪 或  
4 - 氰亞胺 - 3 - 環丙基 - 1, 2, 3, 6 - 四氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪,

## 五、發明說明 (18)

4 - 硝基亞胺 - 3 - ( 2 - 苯基乙基 ) - 過氫 - 1 , 3 , 5 - 噁二嗪或 4 - 硝基亞胺 - 3 - ( 2 - 苯基乙基 ) - 1 , 2 , 3 , 6 - 四氫 - 1 , 3 , 5 - 噁二嗪 ( 熔點 123 - 125 °C ) 。

實例 H 3 : 5 - ( 氯吡啶 - 5 - 基甲基 ) - 3 - 甲基 - 硝基亞胺基 - 過氫 - 1 , 3 , 5 - 噁二嗪 ( 表 1 , 化合物 1 . 2 )



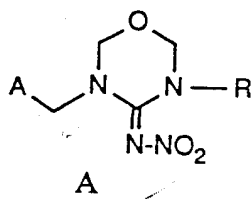
1 . 44 克的 3 - 甲基 - 4 - 硝基亞胺 - 過氫 - 1 , 3 , 5 - 噁二嗪 , 2 . 2 克的 2 - 氯 - 5 - 氯甲基吡啶 , 3 . 7 克的碳酸鉀和 20 毫升的 N , N - 二甲基甲醯胺的混合物在 50 °C 被加熱 4 小時 , 過濾 , 濾液在真空下於一旋轉蒸發器中被蒸發 , 殘留物被色層分析 [ 矽膠 ] 純化 ; 二氯甲烷 / 甲醇 ( 95 : 5 ) , 得到標題化合物 , 熔點為 116 - 118 °C 。

實例 H 4 : 用類似實例 H 1 到 H 3 的方法製備列於表 1 和 2 的化合物 , 每種化合物的 " 物理資料 " 欄中的溫度為攝氏 , 代表化合物熔點。

五、發明說明 (29)

表1

化合物  
編號



R

物理資料

1.1		CH <sub>3</sub>	
1.2		CH <sub>3</sub>	116-118°
1.3		CH <sub>3</sub>	132-134°
1.4		CH <sub>3</sub>	210° (分解)

table

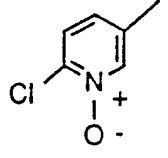
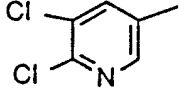
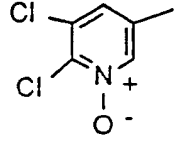
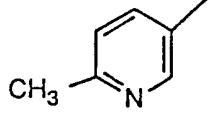
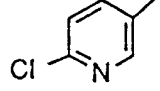
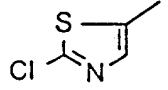
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂



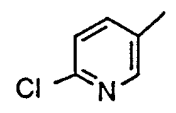
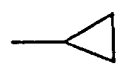
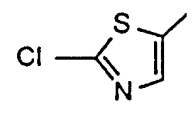
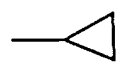
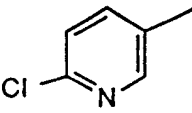
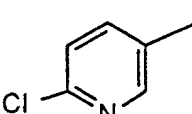
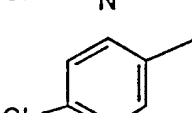
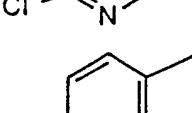
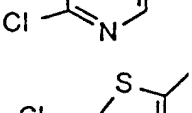
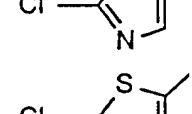
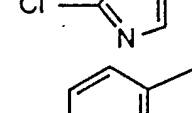
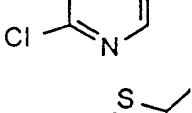
五、發明說明 (✓)

1.5		CH <sub>3</sub>	188-191°
1.6		CH <sub>3</sub>	
1.7		CH <sub>3</sub>	199° (石解)
1.8		CH <sub>3</sub>	141-144°
1.9		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
1.10		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝  
訂  
線

五、發明說明 (此)

化合物 編号	A	R	物理資料
1.11			
1.12			
1.13		n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	樹脂
1.14		n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	樹脂
1.15		烯丙基	樹脂
1.16		炔丙基	103-108°
1.17		n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	71-73°
1.18		炔丙基	176°
1.19		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	樹脂
1.20		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	樹脂

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

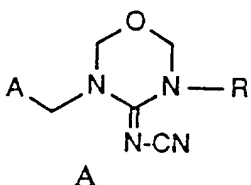
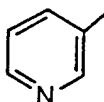
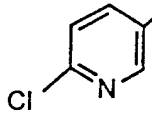
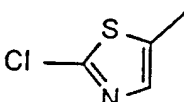
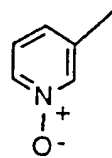
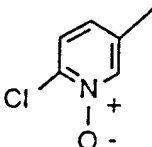
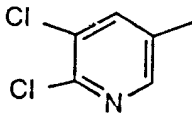
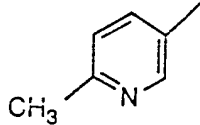
裝

訂

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (4)

表 2

化合物 編號		R	物理資料
2.1		CH <sub>3</sub>	
2.2		CH <sub>3</sub>	108-109°
2.3		CH <sub>3</sub>	92-93°
2.4		CH <sub>3</sub>	
2.5		CH <sub>3</sub>	
2.6		CH <sub>3</sub>	
2.7		CH <sub>3</sub>	

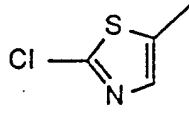
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

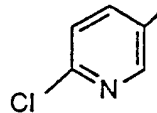
五、發明說明 (47)

2.8



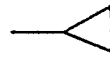
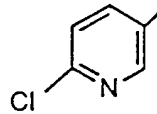
C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>

2.9

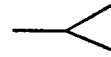
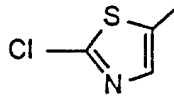


C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>

2.10



2.11



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 訂

## 五、發明說明 (24)

## 配方實例

實例 F 1 : 乳化濃縮物	(a)	(b)	(c)
製備實例活性成份	25%	40%	50%
十二基苯磺酸鈣	5%	8%	6%
蓖麻油聚乙二醇醚 (36mol EO)	5%	-	-
三丁基酚聚乙二醇醚 (30mol EO)	-	12%	4%
環己酮	-	15%	20%
二甲苯混合物	65%	25%	20%

任何希望濃度的乳化液可從任何此種濃度加水稀釋加以製備。

實例 F 2 : 溶液	a)	b)	c)	d)
製備實例的活性成份	80%	10%	5%	95%
乙二醇單甲醚	20%	-	-	-
聚乙二醇 (MW 400)	-	70%	-	-
N-甲基-2-吡咯烷酮	-	20%	-	-
環氧化椰子油	-	-	1%	5%
汽油 (沸點範圍 : 160-190°C)	-	-	94%	-

以上溶液適合以微滴形式加以使用。

實例 F 3 : 顆粒	a)	b)
製備實例的活性成份	5%	10%
高嶺土	94%	-

## 五、發明說明 (V5)

高分散二氧化矽	1%	-
Attapulgate	-	90%

該活性成份被溶於二氯甲烷中，該溶液被噴灑於載體上，溶劑接著在真空中被脫除。

實例 F 4 : 粉塵	a)	b)
製備實例的活性成份	2%	5%
高分散二氧化矽	1%	5%
滑石	97%	-
高嶺土	-	90%

混合載體和活性成份得到立刻可供使用的粉塵。

實例 F 5 : 可濕潤粉末	a)	b)	c)
製備實例的活性成份	20%	50%	75%
木質素磺酸鈉	5%	5%	-
月桂基磺酸鈉	3%	-	5%
二異丁基萘磺酸鈉	-	6%	10%
辛基酚聚乙二醇醚 (7-8mol EO)	-	2%	-
高分散二氧化矽	5%	10%	10%
高嶺土	67%	27%	-

活性成份與添加劑徹底混合，混合物被徹底的在一合適的研磨機中研磨，得到可濕潤的粉末，可被水稀釋成任何濃度的懸浮液。

實例 F 6 : 乳化液濃縮液	a)	b)
製備實例的活性成份	10%	10%

## 五、發明說明 (4b)

辛基酚聚乙二醇醚 (4-5 mol EO)	3%	-
十二基苯磺酸鈣	3%	-
蓖麻油聚二醇醚 (36 mol EO)	4%	-
蓖麻油硫代氧酸鹽	-	25%
環己酮	30%	-
丁醇	-	15%
二甲苯混合物	50%	-
醋酸乙酯	-	50%

任何希望濃度的乳化液可從任何此種濃度加水稀釋加以製備。

實例 F 7 : 粉塵	a)	b)
製備實例的活性成份	5%	8%
滑石	95%	-
高嶺土	-	92%

活性成份與載體混合，混合物在一合適的研磨機中研磨，得到可立即可供使用的粉塵。

## 實例 F 8 : 擠出物顆粒

製備實例的活性成份	10%
木質素磺酸鈉	2%
羧酸甲基纖維素	1%
高嶺土	87%

活性成份與添加劑混合，混合物被研磨，並用水濕潤之，混合物被擠出，接著於一空氣蒸氣中乾燥。

修正

補充

85年7月12日

## 五、發明說明( )

實例 F 9 : 塗佈顆粒

製備實例的活性成份	3%
聚乙二醇 (MW 200)	3%
高嶺土	94%

顆粒微細的活性成份在混合器中被均勻的塗佈於已經被聚乙二醇濕潤的高嶺土，以此方法得到無塵塗佈顆粒。

實例 F 10 : 懸浮液濃縮物

製備實例的活性成份	40%
乙二醇	10%
壬基酚聚乙二醇醚 (15mol EO)	6%
木質素磺酸鈉	10%
羧酸甲基纖維素	1%
37% 甲醛水溶液	0.2%
75% 水性乳液的矽酮油	0.8%
水	32%

顆粒微細的活性成份與添加劑徹底混合，得到一種懸浮液，可被水稀釋成任何濃度的懸浮液。

生物實例 (% 代表重量百分比，除非另有說明)

實例 B 1 : 對象甲 (*Anthonomus grandis*) 活性

幼棉植物被噴以含有 400 ppm 活性成份的水性乳液噴霧混合物，在噴霧塗層乾燥之後，該大豆植物被散



修正  
補充 83年7月18日

## 五、發明說明 ( )

佈植物被散佈於 10 個象甲 (*Anthonomus grandis*) 成虫，並置入一塑膠容器，在 3 天之後才開始進行評估。族群數目減少百分率 (活性%)，或者是入料損失，乃經由比較接受處理與未經處理植物的死亡甲虫和入料損失而獲得。在試驗中，表 1 和 2 化合物都具備優良的活性。活性超過 80% 者特別是以下化合物：1. 2, 1. 3 和 2. 3。

### 實例 B 2：對豆蚜 (*Aphis craccivora*) 活性

豌豆苗被豆蚜 (*Aphis craccivora*) 感染之後，接著被含有 400 ppm 活性成份的噴霧混合物處理，在 20℃ 培養。在 3 天和 6 天之後加以評估。族群數目減少百分率 (活性%) 乃經由比較接受處理而死亡的蚜虫數目與未經處理植物而獲得。

此試驗中，表 1 和 2 的化合物具備優良的活性。活性超過 80% 的特別為以下化合物：1. 2, 1. 3, 1. 15, 2. 2 和 2. 3。

### 實例 B 3：對棉粉虱 (*Bemisia tabaci*) 的活性

矮豆植物被置於紗布籠中，並散佈棉粉虱 (*Bemisia tabaci*) 成虫樣品，當開始產卵之後，所有成虫被移開，10 天之後，植物以及與植物上的蛹一起被一種含有 400 ppm 活性成份的水性乳液噴霧混合物處理，在投與活性成份 14 天之後才開始進行評估，是比較孵出百分率與

(請先閱讀背面之注意事項  
填寫本頁)

裝

訂

線

修正  
補充 83年7月18日

## 五、發明說明 ( )

未經處理的對照組而獲得的。在此試驗中，表 1 和 2 的化合物都具備優良的活性。活性超過 80% 者特別是以下化合物：1. 2 和 1. 3。

實例 B 4：對貓櫛頭蚤 (*Ctenocephalides felis*) 的活性 (系統性)

20 隻貓櫛頭蚤 *Ctenocephalides felis* 成蚤被置於一平底圓籠子，其兩側被紗布密封。一底部被石蠟膜密封的容器被置於此籠子上。此容器盛有含 5 ppm 試驗化合物的血液，在固定 37℃ 被加熱。蚤經由薄膜吸收血液。開始試驗之後的 24 小時進行評估。族群數目減少百分率 (活性%) 乃經由比較接受處理血液和未處理血液的死亡蚤數目。在試驗中，表 1 和 2 化合物都具備對貓櫛頭蚤優良的活性。活性超過 80% 者特別是以下化合物：1. 1 和 1. 3。

實例 B 5：對條葉甲 (*Diabrotica balteata*) 活性

幼玉米植物被噴以含有 400 ppm 活性成份的水性乳液噴霧混合物，在噴霧塗層乾燥之後，該大豆植物被散佈植物被散佈第二階段的 10 個貓櫛頭蚤幼虫並置入一個塑膠容器，在 6 天之後才開始進行評估。族群數目減少百分率 (活性%) 乃經由比較接受處理死亡的幼虫和入料損失與未經處理植物而獲得。在試驗中，表 1 和 2 化合物都

修正

補充

83年7月18日

## 五、發明說明( )

具備優良的活性。活性高於80%的特別是以下的化合物

1. 2, 1. 3, 1. 5和2. 3。

實例 B 6 : 對美洲菸夜蛾 (*Heliothis virescens*) 活性

幼大豆物被噴以含有400ppm活性成份的水性乳液噴霧混合物，在噴霧塗層乾燥之後，該大豆植物被散佈植物被散佈於10個美洲菸夜蛾成虫，並置入一塑膠容器，在6天之後才開始進行評估。族群數目減少百分率（活性%），或者是入料損失，乃經由比較接受處理與未經處理植物的死亡甲虫和入料損失而獲得。在試驗中，表1和2化合物都具備優良的活性。活性超過80%者特別是以下化合物：1. 2, 1. 3和2. 3。

## 實例 B 7 : 對美洲菸夜蛾殺卵 / 幼虫活性

沈積在棉花上的美洲菸夜蛾被噴以含有400ppm活性成份的水性乳液噴霧混合物，8天之後，比較接受處理死亡與未經處理幼虫的孵出百分率和存活率（族群數目減少百分率（活性%）），或者是入料損失，乃經由比較接受處理死亡與未經處理植物而獲得。在試驗中，表1和2化合物都具備優良的活性。

實例 B 8 : 對桃蚜 (*Myzus persicae*) 活性

豌豆苗被桃蚜 (*Myzus persicae*) 感染之後，接著被含

修正

補充

83年7月18日

## 五、發明說明 ( )

有 400 ppm 活性成份的噴霧混合物處理，在 20℃ 培養。在 3 天和 6 天之後加以評估。族群數目減少百分率（活性%）乃經由比較接受處理與未經處理的死亡蚜虫數目植物而獲得。此試驗中，表 1 和 2 的化合物具備優良的活性。活性超過 80% 的特別為以下化合物：1. 2 和 1. 3。

實例 B 9：對桃蚜 (*Myzus persicae*) 活性（系統性）

豌豆苗被桃蚜 (*Myzus persicae*) 感染之後，接著被含有 400 ppm 活性成份的噴霧混合物處理，在 20℃ 培養。在 3 天和 6 天之後加以評估。族群數目減少百分率（活性%）乃經由比較接受處理與未經處理的死亡蚜虫數目植物而獲得。此試驗中，表 1 和的化合物具備優良的活性。活性超過 80% 的特別為以下化合物：1. 2, 1. 3 和 1. 5。

實例 B 10：對黑尾夜蟬 (*Nephotettix cincticeps*) 活性

盛有稻米植物的缸置於一含有 400 ppm 活性成份的水性乳液噴霧混合物處理，在噴霧塗層乾燥之後，稻米植物被散佈第二和第三階段幼虫，在 21 天之後才開始進行評估。虫數目的減少百分率（活性%）乃經由比較經過處理的葉蝗虫數目與未經處理的葉蝗虫數目而獲得。在此試驗中，表 1 和 2 的化合物都具備優良的活性。活性超過

（請先閱讀背面之注意事項）

裝

訂

頁

修正  
補充 83年7月18日

## 五、發明說明 ( )

80%者特別是以下化合物：1.2, 1.3和1.5。

### 實例 B 1 1 : 對黑尾夜蟬系統活性

盛有稻米植物的缸置於一含有400ppm活性成份的水性乳液噴霧混合物處理，在噴霧塗層乾燥之後，稻米植物被散佈第二和第三階段幼虫，在6天之後才開始進行評估。虫數目的減少百分率（活性%）乃經由比較經過處理的葉蝗虫數目與未經處理的葉蝗虫數目而獲得。在此試驗中，表1和2的化合物都具備優良的活性。活性超過80%者特別是以下化合物：1.3, 1.5, 1.13和1.15。

### 實例 B 1 2 : 對稻虱 (*Nillaparvata lugens*) 系統活性

稻米植物被噴灑一含有400ppm活性成份的水性乳液噴霧混合物處理，在噴霧塗層乾燥之後，稻米植物被散佈第二和第三階段幼虫，在21天之後才開始進行評估。虫數目的減少百分率（活性%）乃經由比較經過處理的存活植物蝗虫數目與未經處理的存活植物蝗虫數目而獲得。在此試驗中，表1和2的化合物都具備優良的活性。活性超過80%者特別是以下化合物：1, 2, 1.3, 1.5, 1.8和2.3。

### 實例 B 1 3 : 對稻虱 (*Nillaparvata lugens*) 系統活性

## 五、發明說明( )

盛有稻米植物的缸置於一含有 10 ppm 活性成份的水性乳液噴霧混合物處理，稻米植物被散佈第二和第三階段幼虫，在 6 天之後才開始進行評估。虫數目的減少百分率（活性%）乃經由比較經過處理的存活植物蝗虫數目與未經處理的存活植物蝗虫數目而獲得。在此試驗中，表 1 和 2 的化合物都具備優良的活性。活性超過 80% 者特別是以下化合物：1. 2, 1. 3, 1. 4, 1. 5, 1. 13, 1. 15, 2. 2 和 2. 3。

實例 B 1 4：對德國小蠊 (*Blattella germanica*) 活性

活性成份在丙酮中所形成的溶液 (0.1%) 被置於一培養皿中，其數量相當於 1 克 / 平方米的投藥量。當溶液蒸發時，10 個德國小蠊蛹（最後蛹階段）被置於培養皿中，將之暴露在試驗物質作用之下達 2 小時。然後用二氧化碳麻醉蛹，並轉移到一未用過培養皿上，保時在 25 °C 以及約 70% 大氣濕度的黑暗中。48 小時之後，計算破壞速率以測定殺虫作用。

在此試驗中，表 1 和 2 的化合物都具備優良的活性。活性超過 80% 者特別是以下化合物：1. 3。

實例 B 1 5：對絲光綠蠅 (*Lucilia cuprina*) 活性

30 到 50 個剛剛沈積的絲光綠蠅卵被置於試管中，試管中已經混合 4 毫升營養培養液和含 16 ppm 活性成

修正  
補充 83年7月18日

## 五、發明說明 ( )

份的 1 毫升試驗溶液。在接種培養液之後，試管被一綿毛塞封住，並在 30℃ 的培養器中培養 4 天。直到此時，未處理的培養液中的幼蟲長度約 1 公分（階段 3），如果試驗物質為活性，然後幼蟲若不是已死亡，就是其發育在此時已明顯慢下來。96 小時之後開始評估此試驗。

在此試驗中，表 1 和 2 的化合物都具備優良的活性。活性超過 80% 者特別是以下化合物：1. 3。

實例 B 1 6：對家蠅 (*Musca domestica*) 活性

一塊糖被一數量的物質溶液處理，使得乾燥隔夜之後的試驗物在糖中的濃度為 250 ppm。用此方式處理過的糖塊被置於一鋁碟，並有一濕潤綿毛球和 10 個抗 OP 品種的家蠅成蟲。鋁碟被一玻璃燒杯覆蓋，並在 25℃ 培養。24 小時之後測定死亡率。

在此試驗中，表 1 和 2 的化合物都具備優良的活性。活性超過 80% 者特別是以下化合物：1. 3。

(請先閱讀背面之注意事項)

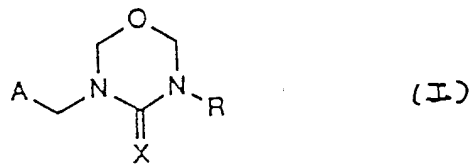
裝  
寫本頁

訂

線

## 四、中文發明摘要(發明之名稱：

1,3,5-噁二嗪衍生物,其製法,製法所用中間體,含該衍生物的殺虫組成物,以該衍生物控制害虫的方法  
一種下式化合物



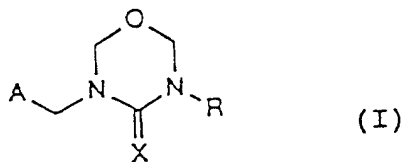
其中

A 為雜環基,其係未被取代,被鹵素或 C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> 烷基單

## 英文發明摘要(發明之名稱：

1,3,5-Oxadiazine Derivatives, Process for Their Preparation, Pesticidal Compositions Containing Them, Method of Controlling Pests Using Them and Intermediates Used in Their Preparation

Compound of the formula



in which

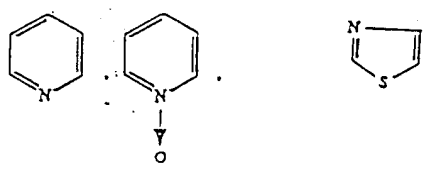
A is heterocyclic radical, which is unsubstituted, mono-



修正  
補充 83年7月18日

四、中文發明摘要 (發明之名稱：

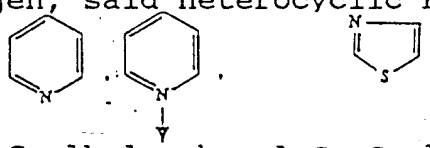
取代，或被鹵素雙取代，該雜環基係



R 為 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 烷基，苯基 - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 烷基，環丙基，  
C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> 烯基或 C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> 炔基；和  
和 X 為 N - NO<sub>2</sub> 或 N - CN，可被作為農化活性成份，  
可用本身已知方法加以製備。

英文發明摘要 (發明之名稱：

substituted by halogen or by C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alkyl, or di-substituted  
by halogen, said heterocyclic radical being



R is C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkyl, cyclopropyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl  
or C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl; and  
X is N-NO<sub>2</sub> or N-CN, can be used as agrochemical active  
ingredients and can be prepared in a manner known per se.

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

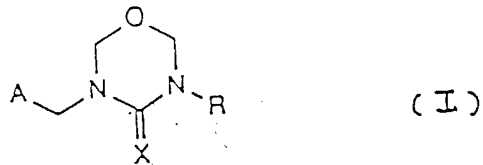
訂

線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

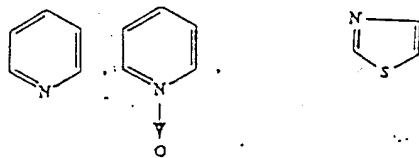
## 六、申請專利範圍

## 1. 一種下式化合物



其中

A 為雜環基，其係未被取代，被鹵素或 C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> 烷基單取代，或被鹵素雙取代，該雜環基係



R 為 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 烷基，苯基 - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 烷基，環丙基，C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> 烯基或 C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> 炔基；和  
和 X 為 N - NO<sub>2</sub> 或 N - CN。

2. 如申請專利範圍第 1 項的化合物，其中 A 的基本環結構上的碳原子被鍵合到式 I 化合物的殘留部份上。

3. 如申請專利範圍第 1 項的化合物，其中 X 為 N - NO<sub>2</sub>。

4. 如申請專利範圍第 2 項的化合物，其中 R 為 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 烷基，苯基 - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 烷基，環丙基，C<sub>3</sub> - C<sub>4</sub> 烯基或 C<sub>3</sub> - C<sub>4</sub> 炔基。

5. 如申請專利範圍第 4 項的化合物，其中 A 為 2 -

## 六、申請專利範圍

氯吡啶 - 5 - 基，2 - 甲基吡啶 - 5 - 基，1 - 氧撐 - 3 - 吡啶並，2 - 氯 - 1 - 氧撐 - 5 - 吡啶並，2, 3 - 二氯 - 1 - 氧撐 - 5 - 吡啶並或 2 - 氯噻唑 - 5 - 基，R 為 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 烷基和 X 為 N - NO<sub>2</sub>。

6. 如申請專利範圍第 5 項的化合物，其中 A 為 2 - 氯吡啶 - 5 - 基或 2 - 氯噻唑 - 5 - 基，R 為 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> 烷基和 X 為 N - NO<sub>2</sub>。

7. 如申請專利範圍第 5 項的化合物，其係選自以下化合物：

(a) 5 - (2 - 氯吡啶 - 5 - 基甲基) - 3 - 甲基 - 4 - 硝基亞胺基過氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪，

(b) 3 - 甲基 - 4 - 硝基亞胺基 - 5 - (1 - 氧撐 - 3 - 吡啶並甲基) 過氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪，

(c) 5 - (2 - 氯 - 1 - 氧撐 - 5 - 吡啶並甲基) - 3 - 甲基 - 4 - 硝基亞胺基過氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪，和

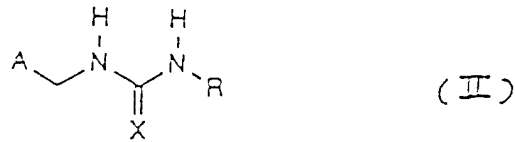
(d) 3 - 甲基 - 5 - (2 - 甲基吡啶 - 5 - 基甲基) - 4 - 硝基亞胺基過氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪。

8. 如申請專利範圍第 6 項的化合物，其係 5 - (2 - 氯噻唑 - 5 - 基甲基) - 3 - 甲基 - 4 - 硝基亞胺基過氫 - 1, 3, 5 - 噁二嗪。

9. 一種製備如申請專利範圍第 1 項的式 I 化合物的方法，其包括

(a) 使一下式化合物

## 六、申請專利範圍



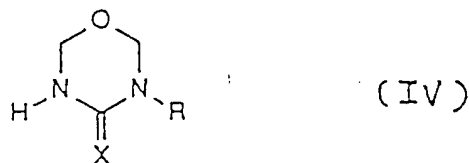
以上化合物為已知或可製備於類似相對應已知化合物，其中 A，R 和 X 定義同式 I，或其互變異構物和 / 或其鹽，與甲醛或仲甲醛反應，較佳在一鹼或更進一步在一酸觸媒中反應，或

(b) 較佳在一鹼存在下，使一相當於式 I 化合物中 R 為氫者（可依類似變數 (a) 或 (c) 製備）或其互變異構物和 / 或其鹽，與一下式化合物反應



以上化合物為已知或可製備於類似相對應已知化合物，其中 R<sub>x</sub> 定義同式 I 化合物的 R，Y 為一離去基，或

(c) 較佳在一鹼存在下使一下式化合物



其中 R 和 X 定義同式 I，或其互變異構物和 / 或其鹽，與一下式化合物反應



以上化合物為已知或可製備於類似相對應已知化合物，其中 A 定義同式 I，Y 為一離去基，或與其鹽反應，和 / 或

(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

，視需要，將可製備於本方法或不同方法的式 I 化合物轉變成不同的式 I 化合物。

10 · 一種殺虫組成物，其係包括至少一種如申請專利範圍第 1 項的化合物作為活性成份，以及至少一種助劑。

11 · 如申請專利範圍第 10 項的組成物，其係用作控制昆虫之用。

12 · 如申請專利範圍第 1 項的化合物，其係用於製備如申請專利範圍第 10 項的組成物。

13 · 如申請專利範圍第 10 項的組成物，其係用於控制害虫。

14 · 如申請專利範圍第 10 項的組成物，其係用於控制有價值農業，園藝和森林植物和裝飾品用植物，或在部份此類植物上的昆虫。

15 · 如申請專利範圍第 10 項的組成物，其係用於保護植物繁衍部份，特別是植物種子。

16 · 一種控制害虫的方法，其包括投與一種如申請專利範圍第 10 項的組成物予害虫或其棲息地。

17 · 如申請專利範圍第 16 項的方法，其係用於控制昆虫。

18 · 如申請專利範圍第 16 項的方法，其用於保護植物繁衍部位，特別是植物種子，其包括處理植物繁衍部位或處理植物繁衍部位種植地。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

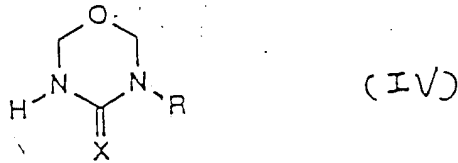
訂

線

## 六、申請專利範圍

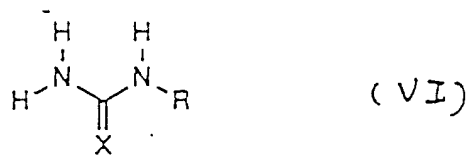
19. 如申請專利範圍第10項的組成物，其包括作為助劑的植物種子，助劑具備載體的效用。

20. 一種下式化合物



其中 R 和 X 定義同式 I，或其互變異構物，以自由形態或其鹽存在。

21. 一種製備如申請專利範圍第20項的式IV化合物或其互變異構物（在每一種情況下為自由形態或鹽形態）在方法，其包括（d）使一下式化合物



以上化合物為已知或可製備於類似相對應已知化合物，其中 R 和 X 定義同式 I，或其互變異構物和 / 或其鹽，與甲醛或仲甲醛反應，例如在類似變數（a）所述方法中一式 I I 化合物或其互變異構物和 / 或其鹽與甲醛或仲甲醛的相對應反應，或

（e）使可製備於類似變數（d）之相當於式IV化合物中 R 為氫者（可依照變數（d）製備）或其互變異構物和 / 或其鹽，與一下式化合物反應



## 六、申請專利範圍

以上化合物為已知或可製備於類似相對應已知化合物，其中  $R_x$  定義同式 I 的 R，Y 為一離去基，例如在類似變數 (d) 所述方法中以相當於式 I 化合物的相對應反應或其互變異構物和 / 或其鹽與一式 I I I 化合物反應，和 / 或，視需要，將式 I V 化合物或其互變異構物（在每一種情況之下為自由形態或鹽形態，係製備自本發明或不同方法）轉變成不同的式 I V 化合物或其互變異構物，分離本發明方法所製得的異構物混合物，而分離出所希望得到的異構物和 / 或製備自本發明方法的一自由態式 I 化合物或其一互變異構物，被轉化成一鹽，或一製備自本發明方法的式 I 化合物或其一互變異構物的鹽，被轉化成自由態式 I 化合物或其一互變異構物，或轉化成不同的鹽。

22. 如申請專利範圍第 20 項的化合物或其互變異構物（在每一種情況之下為自由形態或鹽形態），以用於製備如申請專利範圍第 1 項的化合物。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線