

(21)申請案號：108103507

(22)申請日：中華民國 108 (2019) 年 01 月 30 日

(51)Int. Cl. :

C07D261/04 (2006.01)

C07D413/12 (2006.01)

A01N43/80 (2006.01)

A01N25/02 (2006.01)

A01N25/08 (2006.01)

A01P9/00 (2006.01)

(30)優先權：2018/02/12 美國

62/629154

2018/02/17 美國

62/631665

2018/04/13 美國

62/657647

(71)申請人：美商富曼西公司(美國) FMC CORPORATION (US)

美國

(72)發明人：蘇 明 XU, MING (US)；拉姆 喬治 菲利普 LAHM, GEORGE PHILIP (US)；隆

傑佛瑞 基斯 LONG, JEFFREY KEITH (US)

(74)代理人：陳傳岳；郭雨嵐

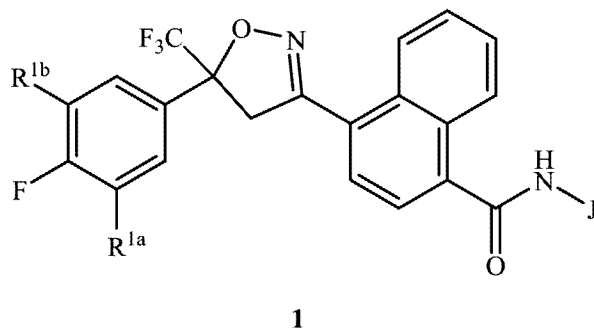
申請實體審查：無 申請專利範圍項數：17 項 圖式數：0 共 139 頁

(54)名稱

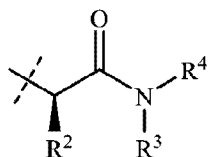
用於防治無脊椎害蟲之茶異噁唑啉化合物

(57)摘要

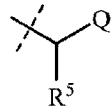
公開了式 1 之化合物，



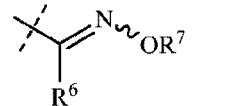
其中，J 為



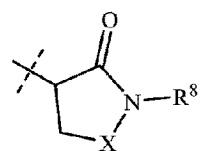
J-1



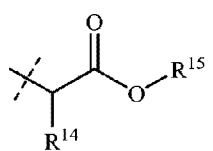
J-2



J-3

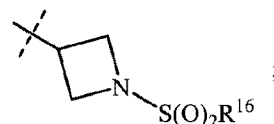


J-4



J-5

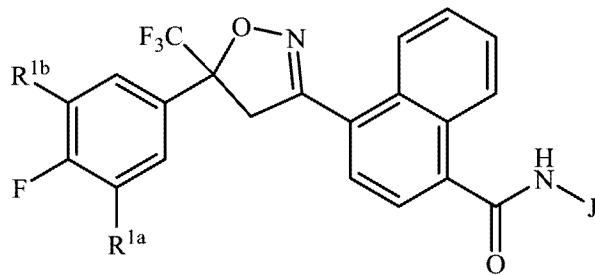
或



J-6

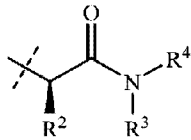
R^{1a} 、 R^{1b} 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 Q ，以及 X 係如本發明所定義。還公開了含有式 1 之化合物之組合物以及防治無脊椎害蟲之方法，包含使無脊椎害蟲或其環境與一生物有效量的本發明之化合物或組合物接觸。

Disclosed are compounds of Formula 1,

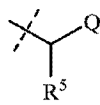


1

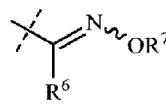
wherein J is



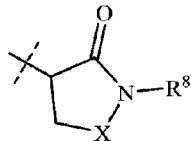
J-1



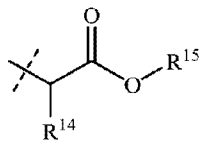
J-2



J-3

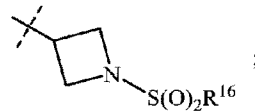


J-4



J-5

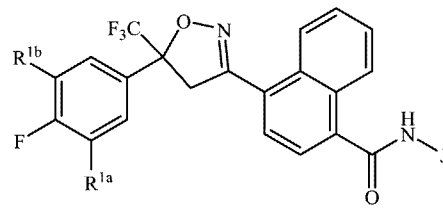
or



J-6

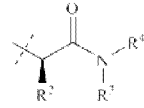
and R^{1a} , R^{1b} , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^{14} , R^{15} , R^{16} , Q and X are as defined in the disclosure. Also disclosed are compositions containing the compounds of Formula 1 and methods for controlling an invertebrate pest comprising contacting the invertebrate pest or its environment with a biologically effective amount of a compound or a composition of the invention.

特徵化學式：



1

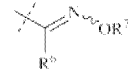
其中，J為



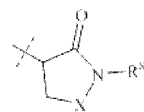
J-1



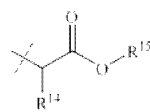
J-2



J-3



J-4



J-5

或



J-6

R^{1a} 、 R^{1b} 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 Q ，以及 X 係如本發明所定義。

【發明說明書】

【中文發明名稱】 用於防治無脊椎害蟲之萘異噁唑啉化合物

【英文發明名稱】 NAPHTHALENE ISOXAZOLINE COMPOUNDS FOR

CONTROLLING INVERTEBRATE PESTS

【技術領域】

【0001】 本發明涉及某些異噁唑啉化合物以及適用於農學及非農學用途之組合物，以及它們用於在農學及非農學環境中防治無脊椎害蟲如節肢動物之方法。

【先前技術】

【0002】 防治無脊椎害蟲對於提高作物效率非常重要。無脊椎害蟲對生長及儲存的農作物之損害可導致生產力的顯著降低，從而導致消費者的成本增加。防治林業、溫室作物、觀賞植物、苗圃作物、儲存食品以及纖維產品、家庭、草坪、木製品以及公共衛生中的無脊椎害蟲也很重要。許多產品可用於這些目的，但仍需要更有效、成本更低、毒性更小、對環境更安全或具有不同作用位點的新化合物。

【發明內容】

【0003】 本發明涉及式1之化合物、含其之組合物，以及其用於防治無脊椎害蟲之用途：

R^5 為 H 或 C_1-C_4 烷基；

R^6 為 H 或 C_1-C_4 烷基；

R^7 為 H、 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 鹵代烷基；

X 為 -O- 或 -C(O)-；

R^8 為 H、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵代烷基或 C_3-C_6 環烷基；

每個 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 以及 R^{13} 獨立地為 H 或 C_1-C_4 烷基；

R^{14} 為 H；或 C_1-C_4 烷基、未被取代或以獨立地選自氰基、硝基、 OR^9 、 $S(O)_nR^{10}$ 、

CO_2R^{11} 以及 $C(O)NR^{12}R^{13}$ 的取代基取代；

R^{15} 為 H、 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 鹵代烷基；

R^{16} 為氟、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵代烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵代烷氧基、
胺基或 C_1-C_6 烷基胺基；

R^{17} 為 H、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵代烷基或 C_3-C_6 環烷基；

Q 為吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、噻嗪基、1,2,4-三嗪基、1,3,5-三嗪基、呋喃基、噁吩基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、1,2,3-三唑基、1,2,4-三唑基、四唑基、噁唑基、噻唑基、異噁唑基、異噻唑基、1,2,3-噁二唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基或 1,3,4-噻二唑基，每個未被取代或以獨立地選自氰基、硝基、鹵素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 鹵代烷硫基、 C_1-C_4 烷基亞磺醯基、 C_1-C_4 鹵代烷基亞磺醯基、 C_1-C_4 烷基磺醯基、 C_1-C_4 鹵代烷基磺醯基、 C_2-C_5 烷氧基羰基、 C_2-C_5 烷基胺基羰基以及 C_3-C_5 二烷基胺基羰基的取代基取代；以及

每個 n 獨立地為 0、1 或 2。

【0004】 本發明還提供一種組合物，其包含式1之化合物以及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑，以及液體稀釋劑所組成之群組的額外組成分。於一具體實施例中，本發明還提供了用於防治無脊椎害蟲之組合物，其包含式1之化合物以及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑，以及液體稀釋劑所組成之群組的額外組成分，該組合物任選還包含至少一種額外的生物活性化合物或試劑。

【0005】 本發明提供了一種防治無脊椎害蟲之方法，包含使無脊椎害蟲或其環境與一生物有效量的式1之化合物（例如，作為本文所述之組合物）接觸。本發明還涉及這樣的方法，其中使無脊椎害蟲或其環境與包含一生物有效量的式1之化合物以及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑以及液體稀釋劑所組成之群組的額外組成分的組合物接觸，該組合物任選還包含一生物有效量的至少一種額外的生物活性化合物或藥劑。

【0006】 本發明還提供了保護一種子免受無脊椎害蟲侵害之方法，包含使該種子與一生物有效量的式1之化合物接觸（例如，作為本文所述之組合物）。本發明還涉及該處理過的種子。

【0007】 本發明還提供了一種增加一作物植物活力之方法，包含使該作物植物，自該作物植物長出的種子，或該作物植物的地點（例如，生長培養基）與一生物有效量的式1之化合物（例如，作為本文所述之組合物）接觸。

【實施方式】

【0008】 如本文所用，術語「包含」、「包括」(comprises、comprising、includes、including)、「具有」(has、having)、「含有」(contains、containing)、

「特徵為(characterized by)」或任何其他變化以涵蓋非排他性的包含、但受到明確指出的任何限制。例如，包含一系列元素的組合物、混合物、製程、方法不一定僅限於那些元素，而是可以包括未明確列出或固有的這些組合物、混合物、製程或方法的其他元素。

【0009】 連接詞「由.....組成」排除任何未指定的元素、步驟，或成分。如果在申請專利範圍中，除了通常與之相關的雜質之外，這樣會排除要求列入除了那些陳述之外的其他材料之要求。如果片語「由.....組成」出現在申請專利範圍主體的一個子句中，而非緊接在前言之後，它只限制該子句中陳述的內容；其他因素並不排除在整體申請專利範圍之外。

【0010】 連接詞用於定義包括除字義上揭示外之材料、步驟、特徵、組份或元件之一組成物或方法，前提為該等其它之材料、步驟、特徵、組份或元件未實質上影響本主張發明之基本及新穎特性。連接詞「基本上由.....組成」介於在「包含」以及「由.....組成」之間的中間地帶。

【0011】 在申請人已經使用開放式連接詞例如「包含」來定義發明或其一部分的情況下，應當容易理解的是(除非另有說明)，描述應該被解釋為也使用術語「基本上由.....組成」或「由.....組成」來描述本發明。

【0012】 此外，除非有明確的相反說明，否則「或」係指包含性的而非排他性的。例如，A或B滿足以下任何一個條件：A為真（或存在）且B為假（或不存在），A為假（或不存在）且B為真（或存在），且A及B都是真實的（或存在）。

【0013】 而且，在本發明的元素或組成分的前面的不定冠詞「一」以及「一個」未限制關於該元素或組成份之實例數量（發生次數）。因此，應理解「一」

或「一個」應包括一個或至少一個，且該元素或組成分的單數形式也包括複數，除非該數字顯然意味著單數。

【0014】 如本發明中所提及的，術語「無脊椎害蟲」包括作為害蟲具有經濟重要性的節肢動物、腹足動物、線蟲，以及蠕蟲。術語「節肢動物」包括昆蟲、蟎蟲、蜘蛛、蝎子、蜈蚣、千足蟲、藥丸蟲，以及綜合蟲。術語「腹足動物」包括蝸牛、蛞蝓，以及其他柄眼目(*Stylommatophora*)動物。術語「線蟲」包括線蟲門的成員。

【0015】 在本發明的上下文中，「無脊椎害蟲防治」意指抑制無脊椎害蟲的發育（包括死亡、餵食減少及/或交配破壞），以及類似的定義。

【0016】 術語「農業學」係指用於食物及纖維的田間作物之生產，包括玉蜀黍或玉米、大豆和其他豆類、稻米、穀物（例如，小麥、燕麥、大麥、黑麥，以及稻米）、葉菜類蔬菜（例如，萵苣、甘藍，以及其他油菜作物）、結果蔬菜（例如，番茄、辣椒、茄子、十字花科以及葫蘆科植物）、馬鈴薯、甘藷、葡萄、棉花、樹果（例如，梨、核果，以及柑橘）、小果（如，漿果及櫻桃），以及其他特種作物（例如，油菜、向日葵，以及橄欖）的生長。

【0017】 術語「非農學」係指非田間作物，例如園藝作物（例如，未和田間種植的溫室、苗圃或觀賞植物）、住宅、農業、商業，以及工業結構、草皮（例如，草皮農場、牧場、高爾夫球場、草坪、運動場等）、木製品、儲存產品、農林業，以及植被管理，以及公共衛生應用。

【0018】 術語「作物活力」係指作物植物的生長速率或生物量積累。「活力增加」係指相對於未處理的對照作物植物，作物植物中的生長或生物量積累增加。術語「作物產量」係指在收穫作物植物後獲得的作物材料在數量及品質方面

的回報。「作物產量的增加」係指相對於未處理的對照作物植物，作物產量的增加。

【0019】 術語「生物有效量」係指當施用於(即接觸)待防治的無脊椎害蟲或其環境時，或施用於植物、該植物自其長出的種子，或該植物的地點（例如，生長培養基），足以產生所需生物效應的生物活性化合物（例如，式1之化合物）的量，以保護該植物免受該無脊椎害蟲的傷害或其它所需的效果（例如，增加植物活力）。

【0020】 在上述敘述中，術語「烷基」，單獨使用或以複合詞如「烷硫基」或「鹵代烷基」使用，包括直鏈或支鏈烷基，如甲基、乙基、正丙基、異丙基，或不同的丁基、戊基或己基異構體。

【0021】 「烷氧基」包括例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基，以及不同的丁氧基、戊氧基，以及己氧基異構體。「烷硫基」包括支鏈或直鏈烷硫基基團，例如甲硫基、乙硫基，以及不同的丙硫基、丁硫基、戊硫基與己硫基異構體。

【0022】 術語「鹵素」，單獨或以複合詞如「鹵代烷基」，或當用於描述如「鹵素取代的烷基」時，包括氟、氯、溴或碘。此外，當用於例如「鹵代烷基」的複合詞中時，或當在例如「鹵素取代的烷基」的描述中使用時，該烷基可以部分或完全被可以相同或不同的鹵素原子取代。「鹵代烷基」或「被鹵素取代的烷基」之實例包括 F_3C- 、 $ClCH_2-$ 、 CF_3CH_2- ，以及 CF_3CCl_2- 。

【0023】 本文所用之化學縮寫 $S(O)$ 與 $S(=O)$ 代表亞磺醯基基團。本文所用之化學縮寫 SO_2 、 $S(O)_2$ 以及 $S(=O)_2$ 代表磺醯基基團。本文所用之化學縮寫 $C(O)$ 與

基團為未被取代的。當基團上的一個或多個位置被稱為「沒有被取代的」或「未被取代的」時，則連接氫原子以吸收任何游離價。

【0029】 當取代基為5-或6-元含氮雜環時，除非另有說明，否則其可透過任何可用的碳或氮環原子與式1的其餘部分連接。

【0030】 本領域已知多種合成方法能夠製備芳香族以及非芳香族雜環及環系統；廣泛的綜述參見Comprehensive Heterocyclic Chemistry的八卷集合，A. R. Katritzky與C. W. Rees主編，Pergamon出版社，牛津，1984年，以及Comprehensive Heterocyclic Chemistry II的十二卷合集，A. R. Katritzky、C. W. Rees與E. F. V. Scriven主編，Pergamon出版社，牛津，1996年。

【0031】 本發明之化合物可以作為一種或多種立體異構物存在。立體異構物是具有相同結構但在原子空間排列方面不同的異構物，包括對映異構物、非對映異構物、順式-反式異構物（也稱為幾何異構物）以及阻轉異構物。阻轉異構物是由於旋轉屏障夠高而允許異構物質分離而受到圍繞單鍵的旋轉限制。本領域技術人員將會理解，當相對於其他立體異構物富集或當與其他立體異構物分離時，一種立體異構物可更具有活性及/或可以表現出有益效果。另外，本領域技術人員知道如何分離、富集及/或選擇性地製備該立體異構物。關於立體異構的所有方面的全面討論，參見Ernest L. Eliel與Samuel H. Wilen, Stereochemistry of Organic Compounds, John Wiley & Sons, 1994年。

【0032】 選自式1之化合物通常以多於一種的形式存在，因此式1包括式1所代表的化合物的所有結晶形式以及非結晶形式。非結晶形式包括固體如蠟以及樹膠的具體實施例以及液體如溶液以及熔體的具體實施例。結晶形式包括基本上代表單晶類型的具體實施例以及代表多晶型混合物（即不同結晶類型）的具

體實施例。術語「多晶型物」係指可以不同結晶形式結晶的化學化合物的特定結晶形式，這些形式具有晶格中分子的不同排列及/或構象。儘管多晶型物可具有相同的化學組成，但由於存在或不存在共結晶水或其他分子，所以它們在組成上也可以不同，該分子可以弱結合或強結合在晶格中。多晶型可在例如晶體形狀、密度、硬度、顏色、化學穩定性、熔點、吸濕性、懸浮性、溶解速率以及生物可利用性等化學、物理以及生物特性方面有所不同。本領域技術人員將會理解，由式1表示的化合物的多晶型物相對於由式1表示的相同化合物的另一種多晶型物或多晶型物的混合物可表現出有益效果（例如，製備有用製劑的適用性，改善的生物學性能）。由式1表示的化合物的特定多晶型物的製備以及分離可以透過本領域技術人員已知之方法實現，包括例如使用選定的溶劑以及溫度進行結晶。本發明之化合物可作為一或多種結晶多晶型物存在。本發明包含單個多晶型物與多晶型物的混合物，包括富含一種相對於其他多晶型物的混合物。關於多態性的綜合討論參見R. Hilfiker編輯，*Polymorphism in the Pharmaceutical Industry*, Wiley-VCH, Weinheim, 2006。

【0033】 如發明內容中所述之本發明的具體實施例包括以下描述的那些。於以下具體實施例中，除非在該具體實施例中進一步定義，否則提及「式1之化合物」包括於發明內容中所指定的取代基之定義。

【0034】 具體實施例 1.一種式1之化合物，其中J為J-1。

【0035】 具體實施例 1a.一種具體實施例 1之化合物，其中R²為C₁-C₄ 烷基、未被取代或以獨立地選自OMe、SMe、S(O)Me，以及SO₂Me的取代基取代。

【0036】 具體實施例 1b.一種具體實施例 1a之化合物，其中R²為以OMe、SMe、S(O)Me或SO₂Me取代的C₁-C₄ 烷基。

【0037】 具體實施例 1c. 一種具體實施例 1a之化合物，其中 R^2 為 C_1-C_4 烷基。

【0038】 具體實施例 1d. 一種具體實施例 1c之化合物，其中 R^2 為甲基。

【0039】 具體實施例 1e. 一種具體實施例 1-1d任一種之化合物，其中 R^3 為H或甲基。

【0040】 具體實施例 1f. 一種具體實施例 1-1d任一種之化合物，其中 R^4 為H、 C_1-C_2 烷基，或 C_1-C_2 鹵代烷基。

【0041】 具體實施例 2. 一種式1之化合物，其中J為J-2。

【0042】 具體實施例 2a. 一種具體實施例 2或2a之化合物，其中 R^5 為H或甲基。

【0043】 具體實施例 2b. 一種具體實施例 2a 之化合物，其中 R^5 為甲基。

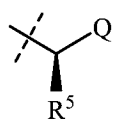
【0044】 具體實施例 2c. 一種具體實施例 2a 之化合物，其中 R^5 為H。

【0045】 具體實施例 2d. 一種具體實施例 2-2c 任一種之化合物，其中Q為吡啶基或嘧啶基。

【0046】 具體實施例 2e. 一種具體實施例 2d 之化合物，其中Q為吡啶基。

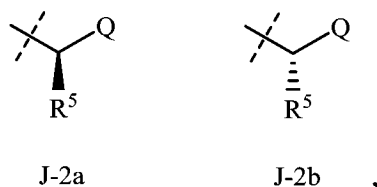
【0047】 具體實施例 2f. 一種具體實施例 2d之化合物，其中Q為嘧啶基。

【0048】 具體實施例 2g. 一種具體實施例 2-2f任一種之化合物，其中J-2為



J-2a 。

【0049】 具體實施例 3. 一種由式1之化合物組成之組合物，其中J為J-2a以及一種式1之化合物，其中J為J-2b



其中，其中 J 為 J-2a 的式 1 之化合物與其中 J 為 J-2b 的式 1 之化合物之比例為大於 60:40。

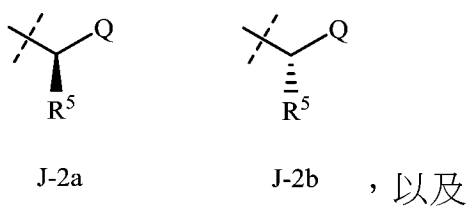
【0050】 具體實施例 3a. 一種具體實施例 3 之組合物，其中，其中 J 為 J-2a 的式 1 之化合物與其中 J 為 J-2b 的式 1 之化合物之比例為大於 80:20。

【0051】 具體實施例 3b. 一種具體實施例 3 之組合物，其中，其中 J 為 J-2a 的式 1 之化合物與其中 J 為 J-2b 的式 1 之化合物之比例為大於 90:10。

【0052】 具體實施例 3c. 一種具體實施例 3 之組合物，其中，其中 J 為 J-2a 的式 1 之化合物與其中 J 為 J-2b 的式 1 之化合物之比例為大於 95:5。

【0053】 具體實施例 3d. 一種具體實施例 3 之組合物，其中，其中 J 為 J-2a 的式 1 之化合物與其中 J 為 J-2b 的式 1 之化合物之比例為大於 99:1。

【0054】 具體實施例 3e. 一種由式 1 之化合物組成之組合物，其中 J 為 J-2a 以及一種式 1 之化合物，其中 J 為 J-2b



R⁵ 為甲基；

其中，其中 J 為 J-2a 的式 1 之化合物與其中 J 為 J-2b 的式 1 之化合物之比例為大於 60:40。

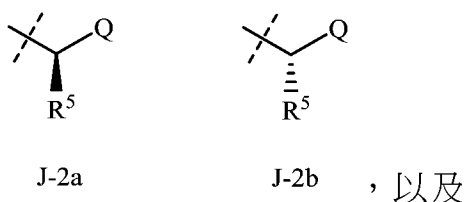
【0055】 具體實施例 3f. 一種具體實施例 3e 之組合物，其中，其中 J 為 J-2a 的式 1 之化合物與其中 J 為 J-2b 的式 1 之化合物之比例為大於 80:20。

【0056】 具體實施例 3g. 一種具體實施例 3e 之組合物，其中，其中J為J-2a的式1之化合物與其中J為J-2b的式1之化合物之比例為大於90:10。

【0057】 具體實施例 3h. 一種具體實施例 3e 之組合物，其中，其中J為J-2a的式1之化合物與其中J為J-2b的式1之化合物之比例為大於95:5。

【0058】 具體實施例 3i. 一種具體實施例 3e 之組合物，其中，其中J為J-2a的式1之化合物與其中J為J-2b的式1之化合物之比例為大於99:1。

【0059】 具體實施例 3j. 一種由式1之化合物組成之組合物，其中J為J-2a以及一種式1之化合物，其中J為J-2b



Q 為吡啶基；

其中，其中 J 為 J-2a 的式 1 之化合物與其中 J 為 J-2b 的式 1 之化合物之比例為大於 60:40。

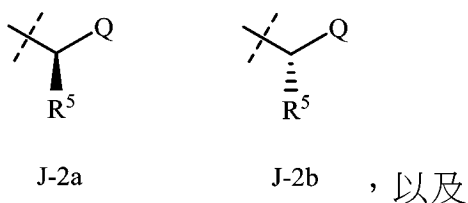
【0060】 具體實施例 3k. 一種具體實施例 3j 之組合物，其中，其中J為J-2a的式1之化合物與其中J為J-2b的式1之化合物之比例為大於80:20。

【0061】 具體實施例 3l. 一種具體實施例 3j 之組合物，其中，其中J為J-2a的式1之化合物與其中J為J-2b的式1之化合物之比例為大於90:10。

【0062】 具體實施例 3m. 一種具體實施例 3j 之組合物，其中，其中J為J-2a的式1之化合物與其中J為J-2b的式1之化合物之比例為大於95:5。

【0063】 具體實施例 3n. 一種具體實施例 3j 之組合物，其中，其中J為J-2a的式1之化合物與其中J為J-2b的式1之化合物之比例為大於99:1。

【0064】 具體實施例 3o. 一種由式1之化合物組成之組合物，其中J為J-2a以及一種式1之化合物，其中J為J-2b



Q 為嘧啶基；

其中，其中 J 為 J-2a 的式 1 之化合物與其中 J 為 J-2b 的式 1 之化合物之比例為大於 60:40。

【0065】 具體實施例 3p. 一種具體實施例 3o 之組合物，其中，其中 J 為 J-2a 的式 1 之化合物與其中 J 為 J-2b 的式 1 之化合物之比例為大於 80:20。

【0066】 具體實施例 3q. 一種具體實施例 3o 之組合物，其中，其中 J 為 J-2a 的式 1 之化合物與其中 J 為 J-2b 的式 1 之化合物之比例為大於 90:10。

【0067】 具體實施例 3r. 一種具體實施例 3o 之組合物，其中，其中 J 為 J-2a 的式 1 之化合物與其中 J 為 J-2b 的式 1 之化合物之比例為大於 95:5。

【0068】 具體實施例 3s. 一種具體實施例 3o 之組合物，其中，其中 J 為 J-2a 的式 1 之化合物與其中 J 為 J-2b 的式 1 之化合物之比例為大於 99:1。

【0069】 具體實施例 4. 一種式 1 之化合物，其中 J 為 J-3。

【0070】 具體實施例 4a. 一種具體實施例 4 之化合物，其中 R⁶ 為 H。

【0071】 具體實施例 4b. 一種具體實施例 4 之化合物，其中 R⁷ 為 C₁-C₄ 烷基。

【0072】 具體實施例 4c. 一種具體實施例 4b 之化合物，其中 R⁷ 為甲基或乙基。

【0073】 具體實施例 4d. 一種具體實施例 4c 之化合物，其中 R^7 為甲基。

【0074】 具體實施例 5. 一種式 1 或具體實施例 1 之化合物，其中 J 為 J-4。

【0075】 具體實施例 5a. 一種具體實施例 5 之化合物，其中 X 為 -O-。

【0076】 具體實施例 5b. 一種具體實施例 5 之化合物，其中 X 為 -C(O)-。

【0077】 具體實施例 5c. 一種具體實施例 5、5a 或 5b 之化合物，其中 R^8 為 C_1-C_2 烷基或 C_1-C_2 鹵代烷基。

【0078】 具體實施例 5d. 一種具體實施例 5c 之化合物，其中 R^8 為甲基或乙基。

【0079】 具體實施例 5e. 一種具體實施例 5d 之化合物，其中 R^8 為甲基。

【0080】 具體實施例 6. 一種式 1 之化合物，其中 J 為 J-5。

【0081】 具體實施例 6a. 一種具體實施例 6 之化合物，其中 R^{14} 為 C_1-C_4 烷基。

【0082】 具體實施例 6b. 一種具體實施例 6a 之化合物，其中 R^{14} 為甲基或乙基。

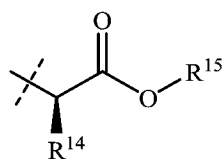
【0083】 具體實施例 6c. 一種具體實施例 6b 之化合物，其中 R^{14} 為甲基。

【0084】 具體實施例 6d. 一種具體實施例 6-6c 任一種之化合物，其中 R^{15} 為 C_1-C_4 烷基。

【0085】 具體實施例 6e. 一種具體實施例 6d 之化合物，其中 R^{14} 為甲基或乙基。

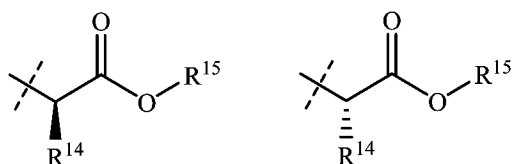
【0086】 具體實施例 6f. 一種具體實施例 6e 之化合物，其中 R^{14} 為甲基。

【0087】 具體實施例 6g. 一種具體實施例 6-6f 任一種之化合物，其中 J-5 為



J-5a

【0088】 具體實施例 7. 一種由式1之化合物組成之組合物，其中J為J-5a以及一種式1之化合物，其中J為J-5b



J-5a

J-5b

其中，其中 J 為 J-5a 的式 1 之化合物與其中 J 為 J-5b 的式 1 之化合物之比例為大於 60:40。

【0089】 具體實施例 7a. 一種具體實施例 7 之組合物，其中，其中 J 為 J-5a 的式 1 之化合物與其中 J 為 J-5b 的式 1 之化合物之比例為大於 80:20。

【0090】 具體實施例 7b. 一種具體實施例 7 之組合物，其中，其中 J 為 J-5a 的式 1 之化合物與其中 J 為 J-5b 的式 1 之化合物之比例為大於 90:10。

【0091】 具體實施例 7c. 一種具體實施例 7 之組合物，其中，其中 J 為 J-5a 的式 1 之化合物與其中 J 為 J-5b 的式 1 之化合物之比例為大於 95:5。

【0092】 具體實施例 7d. 一種具體實施例 7 之組合物，其中，其中 J 為 J-5a 的式 1 之化合物與其中 J 為 J-5b 的式 1 之化合物之比例為大於 99:1。

【0093】 具體實施例 8. 一種式 1 之化合物，其中 J 為 J-6。

【0094】 具體實施例 8a. 一種具體實施例 8 之化合物，其中 R¹⁶ 為 F、甲基或胺基。

【0095】 具體實施例 8b. 一種具體實施例 8a 之化合物，其中 R¹⁶ 為甲基。

【0096】 具體實施例 9. 一種式1之化合物，其中J為以一個氰基取代的C₂-C₄ 烷基。

【0097】 具體實施例 9a. 一種具體實施例 9之化合物，其中J為以一個氰基取代的乙基。

【0098】 具體實施例 9b. 一種具體實施例 9a之化合物，其中J為-CH(CN)CH₃。

【0099】 具體實施例 10. 一種式1之化合物，其中J為以一個氰基取代的-CH₂ (環丙基)。

【0100】 具體實施例 10a. 一種具體實施例 10之化合物，其中J為-CH(CN) (環丙基)。

【0101】 具體實施例 11. 一種式1之化合物，其中J為環丙基，未被取代或以一個氰基或一個C(O)NHR¹⁷取代。

【0102】 具體實施例 11a. 一種具體實施例 11之化合物，其中J為環丙基。

【0103】 具體實施例 11b. 一種具體實施例 11之化合物，其中J為1-(氰基)環丙基。

【0104】 具體實施例 11c. 一種式1之化合物，其中J為以一個氰基取代的C₂-C₄ 烷基；或環丙基。

【0105】 具體實施例 12. 一種式1或具體實施例 1-11c 任一種之化合物，其中R^{1a}為Cl。

【0106】 具體實施例 12a. 一種式1或具體實施例 1-11c任一種之化合物，其中R^{1a}為CF₃。

【0107】 具體實施例 13.一種式**1**或具體實施例 1-12a任一種之化合物，其中 R^{1b} 為H。

【0108】 具體實施例 13a.一種式**1**或具體實施例 1-12a任一種之化合物，其中 R^{1b} 為Cl。

【0109】 具體實施例 14.一種式**1**或具體實施例 1-11c任一種之化合物，其中 R^{1a} 為H且 R^{1b} 為 CF_3 。

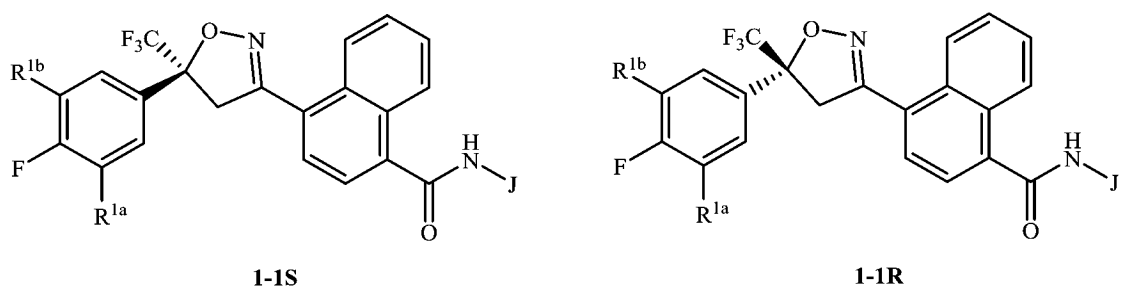
【0110】 具體實施例 15.一種式**1**或具體實施例 1-11c任一種之化合物，其中 R^{1a} 為Cl且 R^{1b} 為Cl。

【0111】 具體實施例 16.一種式**1**或具體實施例 1-11c任一種之化合物，其中 R^{1a} 為Cl且 R^{1b} 為 CF_3 。

【0112】 具體實施例 17.一種式**1**或具體實施例 1-11c任一種之化合物，其中 R^{1a} 為H且 R^{1b} 為 CF_3 ，或 R^{1a} 為Cl且 R^{1b} 為Cl，或 R^{1a} 為Cl且 R^{1b} 為 CF_3 。

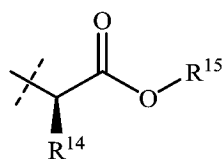
【0113】 具體實施例 17a.一種式**1**或具體實施例 1-11c任一種之化合物，其中 R^{1a} 為H且 R^{1b} 為 CF_3 ，或 R^{1a} 為Cl且 R^{1b} 為Cl。

【0114】 具體實施例 18. 一種由式**1-1S**以及式**1-1R**之化合物組成之組合物



其中該式 **1-1S** 之化合物與該式 **1-1R** 之化合物的比例大於 60:40。

【0115】 具體實施例 18a.一種具體實施例 18之組合物，其中該式**1-1S**之化合物與該式**1-1R**之化合物的比例大於80:20。



J-5a

【0127】 具體實施例 19h. 一種具體實施例 19 之組合物，其中 J 為 J-6。

【0128】 具體實施例 19i. 一種具體實施例 19 之組合物，其中 J 為以一個氰基取代的 C₂-C₄ 烷基。

【0129】 具體實施例 19j. 一種具體實施例 19 之組合物，其中 J 為以一個氰基取代的 -CH₂ (環丙基)。

【0130】 具體實施例 19k. 一種具體實施例 19 之組合物，其中 J 為環丙基，未被取代或以一個氰基或一個 C(O)NHR¹⁷ 取代。

【0131】 具體實施例 20-20k 與具體實施例 19-19k 相同，除了該式 1-1S 之化合物與該式 1-1R 之化合物的比例大於 80:20。

【0132】 具體實施例 21-21k 與具體實施例 19-19k 相同，除了該式 1-1S 之化合物與該式 1-1R 之化合物的比例大於 90:10。

【0133】 具體實施例 22-22k 與具體實施例 19-19k 相同，除了該式 1-1S 之化合物與該式 1-1R 之化合物的比例大於 95:5。

【0134】 具體實施例 23-23k 與具體實施例 19-19k 相同，除了該式 1-1S 之化合物與該式 1-1R 之化合物的比例大於 99:1。

【0135】 包括上述具體實施例 1-23k 以及本文所述之任何其他具體實施例的本發明之具體實施例可以以任何方式組合，且具體實施例中的變量之描述不僅涉及式 1 之化合物，而且還涉及起始化合物以及用於製備式 1 之化合物的中間

體化合物。另外，包括上述具體實施例1-23k以及本文所述之任何其他具體實施例在內的本發明具體實施例及其任何組合屬於本發明之組合物及方法。

【0136】 具體實施例1-23k的組合如下所示：

【0137】 具體實施例A. 一種式1之化合物，其中J為J-1、J-2或J-5。

【0138】 具體實施例B. 該具體實施例 A 之化合物，其中J為J-1。

【0139】 具體實施例C. 該具體實施例 B 之化合物，其中R²為C₁-C₄ 烷基。

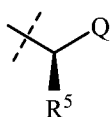
【0140】 具體實施例D. 該具體實施例 C 之化合物，其中R²為甲基。

【0141】 具體實施例E. 該具體實施例 A之化合物，其中J為J-2。

【0142】 具體實施例F. 該具體實施例 E之化合物，其中 R⁵為H或甲基。

【0143】 具體實施例G. 該具體實施例 F之化合物，其中Q為吡啶基或嘧啶基。

【0144】 具體實施例H. 該具體實施例 E、F或G 任一種之化合物，其中J-2為

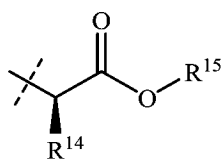


J-2a 。

【0145】 具體實施例I. 該具體實施例 A之化合物，其中J為J-5。

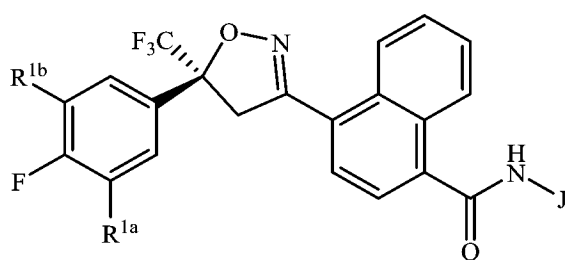
【0146】 具體實施例J. 該具體實施例 I之化合物，其中R¹⁴為C₁-C₄ 烷基。

【0147】 具體實施例K. 該具體實施例 I或J 任一種之化合物，其中J-5為



J-5a 。

【0148】 具體實施例L. 該具體實施例 A-K任一種之化合物，其中該式1之化合物為式1-1S



1-1S

【0149】 具體實施例M. 一種式1之化合物，其中J為以一個氰基取代的C₂-C₄ 烷基；以一個氰基取代的-CH₂（環丙基）；或環丙基、未被取代或以一個氰基或一個C(O)NHR¹⁷取代；或 J-1、J-2或J-5。

【0150】 具體實施例N. 一種具體實施例 M之化合物，其中R^{1a}為Cl且R^{1b}為Cl；或

R^{1a}為 CF₃以及 R^{1b}為 H。

【0151】 具體實施例O. 一種具體實施例 N之化合物，其中J為以一個氰基取代的C₂-C₄ 烷基；或環丙基。

【0152】 具體實施例P. 一種具體實施例 N之化合物，其中J為J-1。

【0153】 具體實施例Q. 一種具體實施例 P之化合物，其中R²為甲基；

R³為 H或甲基；以及

R⁴為 H或甲基。

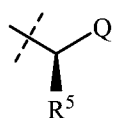
【0154】 具體實施例R. 一種具體實施例 N之化合物，其中J為J-2。

【0155】 具體實施例S. 一種具體實施例 R之化合物，其中R⁵為H或甲基；

以及

Q為吡啶基或嘧啶基。

【0156】 具體實施例T. 一種具體實施例 S之化合物，其中J-2為



J-2a 。

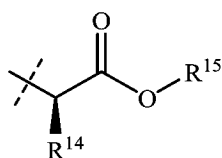
【0157】 具體實施例U. 一種具體實施例 N之化合物，其中J為J-5 。

【0158】 具體實施例V. 一種具體實施例 U之化合物，其中R¹⁴為H或甲基；

以及

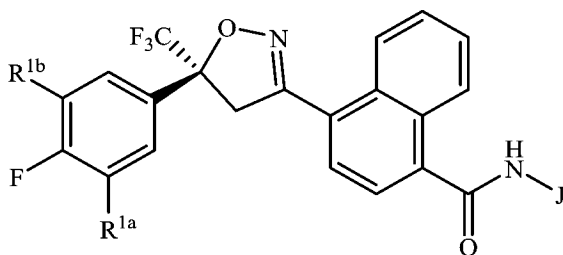
R¹⁵ 為 C₁-C₄ 烷基 。

【0159】 具體實施例W. 一種具體實施例 V之化合物，其中J-5為



J-5a 。

【0160】 具體實施例L-1. 該式1-1S之化合物，其中



1-1S 。

【0161】 具體實施例L-2. 一種1-1S之化合物，其中J為以一個氰基取代的C₂-C₄ 烷基；以一個氰基取代的-CH₂（環丙基）；或環丙基，未被取代或以一個氰基或一個C(O)NHR¹⁷取代；或 J-1、J-2或J-5 。

【0162】 具體實施例L-3. 一種具體實施例 L-2之化合物，其中R^{1a}為Cl且R^{1b}為Cl；或

R^{1a} 為 CF_3 以及 R^{1b} 為 H。

【0163】 具體實施例L-4. 一種具體實施例 L-3之化合物，其中J為以一個氰基取代的 C_2-C_4 烷基；或環丙基。

【0164】 具體實施例L-5. 一種具體實施例 L-3 之化合物，其中J為J-1。

【0165】 具體實施例L-6. 一種具體實施例 L-5之化合物，其中 R^2 為甲基；

R^3 為 H 或甲基；以及

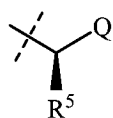
R^4 為 H 或甲基。

【0166】 具體實施例L-7. 一種具體實施例 L-3 之化合物，其中J為J-2。

【0167】 具體實施例L-8. 一種具體實施例 L-7 之化合物，其中 R^5 為H或甲基；以及

Q 為吡啶基或嘧啶基。

【0168】 具體實施例L-9. 一種具體實施例 L-8 之化合物，其中J-2為



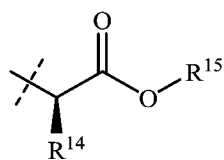
J-2a 。

【0169】 具體實施例L-10. 一種具體實施例 L-3 之化合物，其中J為J-5。

【0170】 具體實施例L-11. 一種具體實施例 L-10之化合物，其中 R^{14} 為H或甲基；以及

R^{15} 為 C_1-C_4 烷基。

【0171】 具體實施例L-12. 一種具體實施例 U 之化合物，其中 J-5為



J-5a

【0172】 特定具體實施例包括式1之化合物，其選自化合物1、3、8、10、11、19、20、33、34、39、50、61、67、69、70，以及71所組成之群組。化合物編號參閱索引表。因此，特定具體實施例包括式1之化合物，係選自由下列所組成之群組：一式1之化合物，其中 R^{1a} 為Cl， R^{1b} 為Cl，J為J-1， R^2 為甲基， R^3 為H， R^4 為H（化合物1）；一式1之化合物，其中 R^{1a} 為Cl， R^{1b} 為Cl，J為J-1， R^2 為甲基， R^3 為H，且 R^4 為甲基（化合物3）；一式1之化合物，其中 R^{1a} 為Cl， R^{1b} 為Cl，J為J-2， R^5 為H，Q為2-嘓啶基（化合物10）；一式1之化合物，其中 R^{1a} 為 CF_3 ， R^{1b} 為Cl，J為J-2， R^5 為H，Q為2-嘓啶基（化合物11）；一式1之化合物，其中 R^{1a} 為Cl， R^{1b} 為Cl，J為J-2， R^5 為甲基，Q為2-嘓啶基（化合物19）；一式1之化合物，其中 R^{1a} 為Cl， R^{1b} 為Cl，J為J-2a， R^5 為甲基，Q為2-吡啶基（化合物20）；一式1之化合物，其中 R^{1a} 為Cl， R^{1b} 為Cl，J為J-3， R^6 為H， R^7 為甲基（化合物33）；一式1之化合物，其中 R^{1a} 為Cl， R^{1b} 為Cl，J為J-4，X為O， R^8 為乙基（化合物34）；一式1之化合物，其中 R^{1a} 為Cl， R^{1b} 為Cl，J為J-5a， R^{14} 為甲基， R^{15} 為甲基（化合物39）；一式1之化合物，其中 R^{1a} 為 CF_3 ， R^{1b} 為H，J為J-2， R^5 為H，Q為2-嘓啶基（化合物50）；一式1之化合物，其中 R^{1a} 為 CF_3 ， R^{1b} 為H，且J為環丙基（化合物67）；一式1之化合物，其中 R^{1a} 為 CF_3 ， R^{1b} 為H，且J為1-(氰基)乙基（化合物69）；一式1之化合物，其中 R^{1a} 為Cl， R^{1b} 為Cl，J為環丙基（化合物70）；一式1之化合物，其中 R^{1a} 為Cl， R^{1b} 為Cl，且J為1-(氰基)乙基（化合物71）；一式1-1S之化合物，其中 R^{1a} 為Cl， R^{1b} 為Cl，J為J-1， R^2 為甲基， R^3 為H，且 R^4 為H（化合物8）；以及一

式1-1S之化合物，其中R^{1a}為Cl，R^{1b}為Cl，J為J-2，R⁵為H，Q為2-嘧啶基（化合物61）。

【0173】 值得注意的是，本發明之化合物的特徵在於有利於代謝及/或土壤殘留模式，且表現出防治農學及非農學無脊椎害蟲範圍的活性。

【0174】 特別值得注意的是，出於無脊椎害蟲防治範圍以及經濟重要性的原因，透過防治無脊椎害蟲保護農作物免受無脊椎害蟲造成的損害或傷害為本發明之具體實施例。本發明之化合物由於其在植物中的有利於易位性或全身性，還可保護未與式1之化合物或包含該化合物之組合物直接接觸的葉片或其它植物部分。

【0175】 非目標生物體中農藥的生物累積為重要的安全考慮因素，且通常希望限制殺蟲劑及/或其代謝物在非目標生物體中的全身暴露及/或積累。例如，如果化合物作為殺蟲劑施用於一作物植物，則希望該化合物不會積聚在脊椎動物的血漿或脂肪中。

【0176】 式1之化合物可在脊椎動物中顯示出有利的藥物代謝動力學特性。特別是，已經發現式1之化合物具有從脊椎動物血漿/血液中快速清除且低分佈到脊椎動物脂肪中的分子，因此降低了不希望的生物累積的可能性。值得注意的是，苯環的4-位置上的氟原子與異噁唑啉環的5-位置連接。

【0177】 可使用藥理學中已知的各種測定方法測量式1之化合物的藥物代謝動力學性質。在涉及單次口服劑量的一種示例性方法中，三隻雄性與三隻雌性大鼠各自透過管餵(oral gavage)接受單劑量的測試物質。透過尾靜脈在0.25、0.5、1、2、4、8、12，以及24小時收集血液，然後每24小時收集一次直至犧牲為止。為了將樣品處理成血漿，將血液收集在含有乙二胺四乙酸

(ethylenediaminetetracetic acid, EDTA) 的試管中，並以約3000 rpm離心以從紅血球中分離血漿。或者，使用微毛細管收集血液並分配到含有HPLC水(1:1, v/v)的試管中。還收集脂肪，均質化並萃取以確定犧牲時式1之化合物的濃度。分析血漿或血液以及脂肪中的式1之化合物及/或代謝物，例如，透過高效液相色層分析 (high-performance liquid chromatography, HPLC) 以及串聯質譜檢測 (LC/MS/MS) 以確定測試物質之濃度。使用非線性模型軟體 (例如, Phoenix® WinNonlin®, Pharsight-A Certara™ 公司, St. Louis, 密蘇里州, 美國) 分析血漿或血液藥物代謝動力學數據，以確定式1之化合物的血漿/血液半衰期，施用後達到最大血漿/血液濃度的時間(T_{max})，最大血漿/血液濃度(C_{max})，以及血漿/血液濃度曲線下面積(AUC)。由於脂肪的分析需要犧牲大鼠，因此在單個時間點 (即犧牲大鼠的時間) 獲得脂肪資料。然後測定脂肪：血漿或脂肪：式1之化合物的血液比率。

【0178】 同樣值得注意的是，本發明之具體實施例為包含任何前述具體實施例的化合物之組合物，以及本文描述之任何其他具體實施例，及其任何組合，以及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑，以及液體稀釋劑所組成之群組的額外組成分，該組合物任選還包含至少一種額外的生物活性化合物或試劑。

【0179】 進一步值得注意的是，本發明之具體實施例為用於防治無脊椎害蟲之組合物，其包含任何前述具體實施例之化合物，以及本文描述之任何其他具體實施例，及其任何組合，以及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑，以及液體稀釋劑所組成之群組的額外組成分，該組合物任選還包含至少一種額外的生物活性化合物或試劑。本發明之具體實施例還包括防治無脊椎害蟲之方法，包

含使無脊椎害蟲或其環境與一生物有效量之任何前述具體實施例的化合物（例如，作為本文所述之組合物）接觸。

【0180】 本發明之具體實施例還包括含有前述具體實施例中任一項的化合物之組合物，其為土壤浸漬液體製劑之形式。本發明之具體實施例還包括防治無脊椎害蟲之方法，包含使土壤與液體組合物接觸，作為土壤灌溉劑，其包含一生物有效量的任何前述具體實施例之化合物。

【0181】 本發明之具體實施例還包括用於防治無脊椎害蟲的噴霧組合物，其包含一生物有效量的任何前述具體實施例之化合物與一推進劑。本發明之具體實施例還包括用於防治無脊椎害蟲的誘餌組合物，其包含一生物有效量的任何前述具體實施例之化合物、一種或多種食物材料、任選的引誘劑，以及任選的保濕劑。本發明之具體實施例還包括用於防治無脊椎害蟲的裝置，其包含該誘餌組合物以及適於接受該誘餌組合物的殼體，其中該殼體具有至少一個開口，該開口的尺寸允許該無脊椎害蟲通過該開口，使得該無脊椎害蟲可以從該殼體外部的的位置接近該誘餌組合物，且其中該殼體還適於放置在無脊椎害蟲的潛在或已知活動的場所中或附近。

【0182】 本發明之具體實施例還包括用於保護一種子免受無脊椎害蟲侵害之方法，包含使該種子與一生物有效量的任何前述具體實施例之化合物接觸。

【0183】 本發明之具體實施例還包括防治無脊椎害蟲之方法，包含使無脊椎害蟲或其環境與一生物有效量的式1之化合物（例如，作為本文所述之組合物）接觸，條件是該方法並非透過治療人體之醫學方法。

【0184】 本發明還涉及一些方法，其中無脊椎害蟲或其環境與包含一生物有效量的式1之化合物，以及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑以及液體

稀釋劑所組成之群組的額外組成分的組合物接觸，該組合物任選還包含一生物有效量的至少一種額外的生物活性化合物或藥劑，條件是該方法並非透過治療人體之醫學方法。

【0185】 式1之化合物可透過如方案1-11中所述之一種或多種下列方法以及變體所製備。除非另有說明，否則下列式1-15化合物中取代基的定義如上文發明說明中所定義。式1a與1b的化合物為式1之化合物的子集，式1a與1b的所有取代基如上對式1所定義者。可以使用以下縮寫：DMF為N,N-二甲基甲醯胺，以及DBU為1,8-二氮雜雙環[5.4.0]十一碳-7-烯。

【0186】 式1a化合物（式1，其中J為J-1、J-2、J-4、J-5或J-6）可透過方案1中所示之方法由式2的化合物所製備。於該方法中，通常在脫水偶聯劑存在下，式2的羧酸與式3的胺化合物（其中J為J-1、J-2、J-4、J-5或J-6）偶合。可用於該方法的偶聯劑包括二環己基碳二亞胺、1-(3-二甲基胺基丙基)-3-乙基碳二亞胺，以及羰基二咪唑。可用於該方法的其他偶聯劑包括1-丙烷-膦酸環酐、1-[雙(二甲基胺基)亞甲基]-1H-1,2,3-三唑並[4,5-b]吡啶-3-氧化物六氟磷酸鹽，以及N-[(二甲基胺基)-1H-1,2,3-三唑並-[4,5-b]吡啶-1-基亞甲基]-N-甲基甲基銨六氟磷酸鹽N-氧化物；這些偶聯劑通常在鹼存在下使用，例如三乙胺、吡啶、4-(二甲基胺基)吡啶或N,N-二異丙基乙胺。典型的反應條件包括無水非質子溶劑，如二氯甲烷、四氫呋喃或DMF，反應溫度於室溫至70°C之間。

【0187】 方案1

【0225】 在沒有進一步的闡述之情況下，相信使用前面之描述的本領域技術人員可以最充分地利用本發明。因此，以下合成實施例僅被解釋為說明性的，且不得以任何方式限制本案。以下合成實施例中的步驟說明了全面合成轉化中的每個步驟的過程，且每個步驟的起始材料可能不一定由其他實施例或步驟中描述過程的特定製備過程準備。除色層分析溶劑混合物或另有說明外，百分數均以重量計。除非另有說明，色層分析溶劑混合物的份數以及百分比按體積計。以來自四甲基矽烷的低磁場 ppm 報告 ^1H NMR 譜；「s」表示單重態，「d」表示雙重態，「t」表示三重態，「q」表示四重態，「m」表示多重態，「dd」表示雙重態的雙重態，「dt」表示三重態的雙重態，「br s」表示寬泛的單重態。DMF 表示 N,N-二甲基甲醯胺。化合物編號參見索引表 A-G。

合成實施例1

製備 N-[(1R)-2-胺基-1-甲基-2-氧代乙基]-4-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-1-萘甲醯胺 (化合物1)

步驟A：製備 4-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-1-萘甲酸甲酯

【0226】 於攪拌的 4-[(羥基亞胺基)甲基]-1-萘甲酸甲酯 (1.50 g, 6.55 mmol) 的 N,N-二甲基甲醯胺 (4.0 mL) 溶液中加入 N-氯代琥珀醯亞胺 (1.05 g, 7.86 mmol)。將該混合物於室溫下攪拌 1.5 小時，然後加入含有 1,3-二氯-4-氟-5-[1-(三氟甲基)乙烯基]苯 (2.04 g, 7.86 mmol) 以及三乙胺 (1.38 mL, 加入 9.83 mmol) 的 N,N-二甲基甲醯胺 (10.0 mL) 溶液。於室溫下再攪拌 2 小時後，將反應混合物以水稀釋並以乙酸乙酯萃取。將有機層以鹽水洗滌，乾燥 (Na_2SO_4)，並減壓濃縮。使以己烷/乙

酸乙酯作為流洗液，透過矽膠管柱色層分析法純化殘餘物，得到標題化合物，為白色固體(1.30 g，43%收率)。

^1H NMR (CDCl_3): 8.87 (m, 1H), 8.78 (m, 1H), 8.08 (d, 1H), 7.67 (m, 2H), 7.63 (d, 2H), 7.52 (d, 1H), 4.27 (d, 1H), 4.02 (s, 3H), 3.89 (d, 1H)。

步驟B：製備4-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-1-萘甲酸

【0227】於攪拌的4-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-1-萘甲酸甲酯(即來自步驟A的產物)(1.20 g，2.47 mmol)的四氫呋喃(10 mL)溶液中加入氫氧化鋰一水合物(0.31 g，7.41 mmol)的水溶液(10 mL)。將得到的混合物於室溫下攪拌整夜。將反應混合物在水及乙醚之間分配。然後將水層以6 N 鹽酸水溶液酸化至pH 2並以乙酸乙酯萃取。將合併的有機層以鹽水洗滌，乾燥並濃縮，得到標題化合物，為白色固體(1.10 g，94%收率)。

^1H NMR (DMSO-d_6): 13.52 (br s, 1H), 8.83 (m, 1H), 8.77 (m, 1H), 8.12 (d, 1H), 7.92 (d, 1H), 7.88 (d, 2H), 7.73 (m, 2H), 4.56 (s, 2H)。

步驟C：製備N-[(1R)-2-胺基-1-甲基-2-氧代乙基]-4-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-1-萘甲醯胺

【0228】在DMF (3 mL)的4-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-1-萘甲酸(即步驟B的產物)(190 mg，0.40 mmol)、(R)-2-胺基丙醯胺鹽酸鹽(97 mg，0.80 mmol)、三乙胺(0.17 mL，1.20 mmol)，以及1-[雙(二甲基胺基)亞甲基-1H-1,2,3-三唑並[4,5-b]吡啶3-氧化鎘六氟磷酸鹽(HATU，182 mg，0.48

mmol)的混合物於室溫下攪拌整夜。然後將反應混合物在乙酸乙酯與水之間分配，分離各相，水相以乙酸乙酯萃取。將合併的有機層以鹽水洗滌，乾燥並濃縮。所得殘餘物通過矽膠管柱色層分析純化，以己烷/乙酸乙酯作沖提液，得到標題產物，即本發明之化合物，為白色固體(180 mg，83%收率)。

$^1\text{H NMR}$ (DMSO- d_6): 8.77 (d, 1H), 8.72 (d, 1H), 8.30 (d, 1H), 7.88 (m, 3H), 7.63-7.72 (m, 3H), 7.46 (br s, 1H), 7.05 (br s, 1H), 4.54 (s, 2H), 4.50 (m, 1H), 1.36 (d, 3H)。

合成實施例2

製備4-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-N-(2-吡啶基甲基)-1-萘甲醯胺(化合物15)

【0229】在DMF (3 mL)的4-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-1-萘甲酸(200 mg，0.42 mmol)、2-吡啶基甲胺(92 mg，0.84 mmol)、三乙胺(0.18 mL，1.26 mmol)，以及1-[雙(二甲基胺基)亞甲基-1H-1,2,3-三唑並[4,5-b]吡啶-3-氧化物六氟磷酸鹽(HATU，240 mg，0.64 mmol)的混合物於室溫下攪拌整夜。然後將反應混合物在乙酸乙酯與水之間分配。分離各相，水相以乙酸乙酯萃取。將合併的有機層以鹽水洗滌，乾燥並濃縮。所得殘餘物通過矽膠管柱色層分析法純化，以己烷/乙酸乙酯作為沖提液，得到標題產物，即本發明之化合物，為白色固體(132 mg，56%收率)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): 8.80 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.36 (d, 1H), 7.71 (ddd, 1H), 7.58-7.66 (m, 5H), 7.49 (s, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.22 (dd, 1H), 4.84 (d, 2H), 4.25 (d, 1H), 3.89 (d, 1H)。

合成實施例3

製備4-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3異噁唑基]-N-[(甲氧基亞胺基)甲基]-1-萘甲醯胺 (化合物33)

步驟A：製備4-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3異噁唑基]-1-萘甲醯胺

【0230】 於在二氯甲烷(20 mL)的4-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3異噁唑基]-1-萘甲酸(500 mg, 1.06 mmol)懸浮液中加入草醯氯(269 mg, 2.12 mmol)與1滴DMF。將混合物於室溫下攪拌1小時，然後濃縮並在減壓下以甲苯蒸餾。將殘餘物溶於THF (5 mL)中並加入氫氧化銨水溶液(3 mL, 14.8M)。將反應混合物於室溫下攪拌4小時，然後在乙酸乙酯與水之間分配。分離各層，水層以乙酸乙酯萃取。將合併的有機層以鹽水洗滌，乾燥並濃縮，得到伯醯胺，為白色固體(490 mg)。粗醯胺不經進一步純化直接用於下一步。

步驟B：製備4-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3異噁唑基]-N-[(甲氧基亞胺基)甲基]-1-萘甲醯胺

【0231】 在甲苯(20 mL)中的4-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3異噁唑基]-1-萘甲醯胺(490 mg)、甲氧基胺鹽酸鹽(266 mg, 3.18 mmol)，以及原甲酸三乙酯(2 mL, 12 mmol)的混合物於70°C下攪拌24小時。冷卻反應混合物並在乙酸乙酯與水之間分配。分離各層，水層以乙酸乙酯萃取。將合併的有機層以鹽水洗滌、乾燥、濃縮，並將殘餘物通過矽膠管柱色層分析法純化，以己烷/乙酸乙酯作為沖提液，得到標題產物，即本發明之化合物，為白色固體(402 mg, 兩步收率72%)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): 8.83 (d, 1H), 8.66 (d, 1H), 8.34 (d, 1H), 7.89 (d, 1H), 7.69 (m, 3H), 7.64 (d, 2H), 7.54 (d, 1H), 4.27 (d, 1H), 3.90 (d, 1H), 3.89 (s, 3H)。

合成實施例4

製備4-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-N-(2-吡啶基甲基)-N-[(4R)-2-乙基-3-氧代-4-異唑烷基]-1-萘甲醯胺 (化合物34)

【0232】 於4-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-1-萘甲酸(200 mg, 0.42 mmol)在二氯甲烷(10 mL)中的懸浮液加入草醯氯(107 mg, 0.84 mmol)以及1滴DMF。將混合物於室溫下攪拌1小時，然後濃縮並在減壓下以甲苯蒸餾。將殘餘物溶於2 mL二氯甲烷中並在室溫下緩慢加入(4R)-4-胺基-2-乙基異噁唑烷-3-酮鹽酸鹽(210 mg, 1.26 mmol)與三乙胺(170 mg, 1.68 mmol)在二氯甲烷(5 mL)中的懸浮液中。於室溫下，將反應混合物攪拌整夜，然後濃縮，並將殘餘物通過矽膠管柱色層分析法純化，以己烷/乙酸乙酯作為沖提液，得到標題化合物，為白色固體(196 mg, 79%收率)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): 8.81 (d, 1H), 8.30 (d, 1H), 7.60-7.67 (m, 5H), 7.45 (d, 1H), 6.85 (br s, 1H), 5.00 (m, 2H), 4.26 (d, 1H), 4.13 (dd, 1H), 3.89 (d, 1H), 3.65 (m, 2H), 1.26 (t, 3H)。

合成實施例5

製備N-[[4-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-1-萘基]羰基]甘胺酸甲酯 (化合物35)

步驟A：製備3-(4-溴-1-萘基)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)異噁唑

【0233】於攪拌的4-溴-1-萘甲酸酐(1.00 g, 4.0 mmol)的N,N-二甲基甲醯胺(12.0 mL)溶液中加入N-氯代琥珀醯亞胺(0.64 g, 4.8 mmol)。將反應混合物於室溫下攪拌1小時，然後加入在N,N-二甲基甲醯胺(12.0 mL)的1,3-二氯, 4-氟-5-[1-(三氟甲基)乙基]苯(1.24 g, 4.8 mmol)與三乙胺(1.68 mL, 12.0 mmol)溶液。於室溫下再攪拌2小時後，將反應混合物以水稀釋並以乙酸乙酯萃取。將有機層以鹽水洗滌，乾燥(Na_2SO_4)，並減壓濃縮。通過矽膠管柱色層分析法純化殘餘物，以己烷/乙酸乙酯作為沖提液，得到標題化合物，為白色固體(1.60 g, 76%收率)。
 $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): 8.88 (m, 1H), 8.35 (m, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.69 (m, 2H), 7.64 (d, 2H), 7.36 (d, 1H), 4.27 (d, 1H), 3.88 (d, 1H)。

步驟B：製備N-[[4-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-1-萘基]羰基]甘胺酸甲酯

【0234】在甲苯(20 mL)中的3-(4-溴-1-萘基)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)異噁唑(1000 mg, 1.97 mmol)、[1,1'-雙(二苯基膦基)-二茂鐵]二氯化鈦(II)(PdCl_2 (dppf))(146 mg, 0.20 mmol)、甘胺酸甲酯鹽酸鹽(371 mg, 2.96 mmol)，以及三乙胺(2.76 mL, 19.7 mmol)混合物以一氧化碳吹掃15分鐘。將反應混合物於70°C及一氧化碳氣氛下攪拌整夜。將混合物冷卻至室溫，通過短Celite®矽藻土助濾劑墊過濾，並以少量乙酸乙酯沖洗。濃縮濾液，將殘餘物通過矽膠管柱色層分析法純化，以己烷/乙酸乙酯作為沖提液，得到標題產物，即本發明之化合物，為白色固體(600 mg, 56%收率)。

$^1\text{H NMR}$ (DMSO-d_6): 9.13 (t, 1H), 8.78 (d, 1H), 8.32 (d, 1H), 7.90 (m, 3H), 7.70 (m, 3H), 4.53 (s, 2H), 4.11 (d, 2H), 4.74 (s, 3H)。

【0235】 上述合成實施例1為製備式1之化合物的實施例，其中J為J-1。

【0236】 上述合成實施例2為製備式1之化合物的實施例，其中J為J-2。

【0237】 上述合成實施例3為製備式1之化合物的實施例，其中J為J-3。

【0238】 上述合成實施例4為製備式1之化合物的實施例，其中J為J-4。

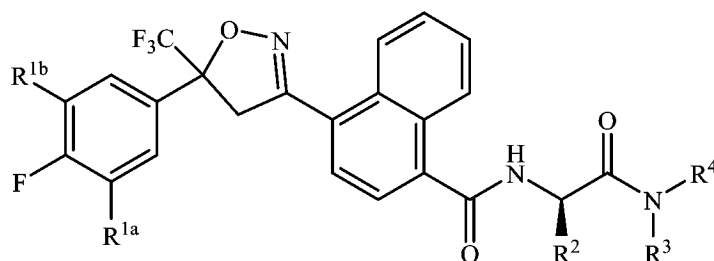
【0239】 上述合成實施例5為製備式1之化合物的實施例，其中J為J-5。

【0240】 其中J為J-6的式1之化合物可通過類似於上述合成實施例1、2、4以及5中所述之方法製備。

【0241】 式1之化合物，其中J為(i)被一個氰基取代的C₂-C₄烷基，(ii)被一個氰基取代的-CH₂（環丙基），或(iii)環丙基，未被取代或被一個氰基或一個C(O)NHR¹⁷取代，可透過類似於上述合成實施例1、2、4，以及5中所述之方法製備。

【0242】 透過本文所述之方法以及本領域已知的方法，可以製備下列表1-1至7-2的化合物。以下表格中使用以下縮寫：Me表示甲基，Et表示乙基，i-Pr表示異丙基，i-Bu表示異丁基，以及OMe表示甲氧基。

【0243】 表1-1

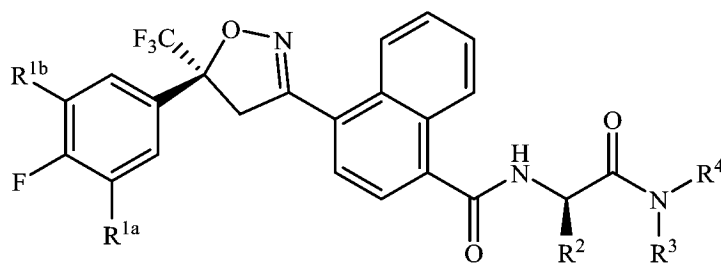


R ^{1a}	R ^{1b}	R ²	R ³	R ⁴	R ^{1a}	R ^{1b}	R ²	R ³	R ⁴
Cl	Cl	Me	H	H	CF ₃	H	Me	H	H
Cl	Cl	Cl	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me
Cl	Cl	Me	H	Et	CF ₃	H	Me	H	Et
Cl	Cl	Me	H	i-Pr	CF ₃	H	Me	H	i-Pr
Cl	Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CF ₃

Cl	Cl	Me	Me	H		CF ₃	H	Me	Me	H
Cl	Cl	Me	Me	Me		CF ₃	H	Me	Me	Me
Cl	Cl	Me	Me	Et		CF ₃	H	Me	Me	Et
Cl	Cl	Me	Me	i-Pr		CF ₃	H	Me	Me	i-Pr
Cl	Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	Et	H	H		CF ₃	H	Et	H	H
Cl	Cl	Et	H	Me		CF ₃	H	Et	H	Me
Cl	Cl	Et	H	Et		CF ₃	H	Et	H	Et
Cl	Cl	Et	H	i-Pr		CF ₃	H	Et	H	i-Pr
Cl	Cl	Et	H	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	Et	H	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	Et	Me	H		CF ₃	H	Et	Me	H
Cl	Cl	Et	Me	Me		CF ₃	H	Et	Me	Me
Cl	Cl	Et	Me	Et		CF ₃	H	Et	Me	Et
Cl	Cl	Et	Me	i-Pr		CF ₃	H	Et	Me	i-Pr
Cl	Cl	Et	Me	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	Et	Me	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	i-Pr	H	H		CF ₃	H	i-Pr	H	H
Cl	Cl	i-Pr	H	Me		CF ₃	H	i-Pr	H	Me
Cl	Cl	i-Pr	H	Et		CF ₃	H	i-Pr	H	Et
Cl	Cl	i-Pr	H	i-Pr		CF ₃	H	i-Pr	H	i-Pr
Cl	Cl	i-Pr	H	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	i-Pr	H	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	i-Pr	Me	H		CF ₃	H	i-Pr	Me	H
Cl	Cl	i-Pr	Me	Me		CF ₃	H	i-Pr	Me	Me
Cl	Cl	i-Pr	Me	Et		CF ₃	H	i-Pr	Me	Et
Cl	Cl	i-Pr	Me	i-Pr		CF ₃	H	i-Pr	Me	i-Pr
Cl	Cl	i-Pr	Me	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	i-Pr	Me	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	i-Bu	H	H		CF ₃	H	i-Bu	H	H
Cl	Cl	i-Bu	H	Me		CF ₃	H	i-Bu	H	Me
Cl	Cl	i-Bu	H	Et		CF ₃	H	i-Bu	H	Et
Cl	Cl	i-Bu	H	i-Pr		CF ₃	H	i-Bu	H	i-Pr
Cl	Cl	i-Bu	H	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	i-Bu	H	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	i-Bu	Me	H		CF ₃	H	i-Bu	Me	H
Cl	Cl	i-Bu	Me	Me		CF ₃	H	i-Bu	Me	Me
Cl	Cl	i-Bu	Me	Et		CF ₃	H	i-Bu	Me	Et
Cl	Cl	i-Bu	Me	i-Pr		CF ₃	H	i-Bu	Me	i-Pr
Cl	Cl	i-Bu	Me	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	i-Bu	Me	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	CH ₂ OH	H	H		CF ₃	H	CH ₂ OH	H	H
Cl	Cl	CH ₂ OH	H	Me		CF ₃	H	CH ₂ OH	H	Me
Cl	Cl	CH ₂ OH	H	Et		CF ₃	H	CH ₂ OH	H	Et
Cl	Cl	CH ₂ OH	H	i-Pr		CF ₃	H	CH ₂ OH	H	i-Pr
Cl	Cl	CH ₂ OH	H	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	CH ₂ OH	H	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	CH ₂ OH	Me	H		CF ₃	H	CH ₂ OH	Me	H
Cl	Cl	CH ₂ OH	Me	Me		CF ₃	H	CH ₂ OH	Me	Me
Cl	Cl	CH ₂ OH	Me	Et		CF ₃	H	CH ₂ OH	Me	Et
Cl	Cl	CH ₂ OH	Me	i-Pr		CF ₃	H	CH ₂ OH	Me	i-Pr
Cl	Cl	CH ₂ OH	Me	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	CH ₂ OH	Me	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	CH ₂ OMe	H	H		CF ₃	H	CH ₂ OMe	H	H
Cl	Cl	CH ₂ OMe	H	Me		CF ₃	H	CH ₂ OMe	H	Me
Cl	Cl	CH ₂ OMe	H	Et		CF ₃	H	CH ₂ OMe	H	Et
Cl	Cl	CH ₂ OMe	H	i-Pr		CF ₃	H	CH ₂ OMe	H	i-Pr
Cl	Cl	CH ₂ OMe	H	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	CH ₂ OMe	H	CH ₂ CF ₃

Cl	Cl	CH ₂ OMe	Me	H	CF ₃	H	CH ₂ OMe	Me	H
Cl	Cl	CH ₂ OMe	Me	Me	CF ₃	H	CH ₂ OMe	Me	Me
Cl	Cl	CH ₂ OMe	Me	Et	CF ₃	H	CH ₂ OMe	Me	Et
Cl	Cl	CH ₂ OMe	Me	i-Pr	CF ₃	H	CH ₂ OMe	Me	i-Pr
Cl	Cl	CH ₂ OMe	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OMe	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Me	H	H	CF ₃	Cl	i-Bu	H	H
CF ₃	Cl	Me	H	Me	CF ₃	Cl	i-Bu	H	Me
CF ₃	Cl	Me	H	Et	CF ₃	Cl	i-Bu	H	Et
CF ₃	Cl	Me	H	i-Pr	CF ₃	Cl	i-Bu	H	i-Pr
CF ₃	Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Cl	i-Bu	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Me	Me	H	CF ₃	Cl	i-Bu	Me	H
CF ₃	Cl	Me	Me	Me	CF ₃	Cl	i-Bu	Me	Me
CF ₃	Cl	Me	Me	Et	CF ₃	Cl	i-Bu	Me	Et
CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr	CF ₃	Cl	i-Bu	Me	i-Pr
CF ₃	Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Cl	i-Bu	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Et	H	H	CF ₃	Cl	CH ₂ OH	H	H
CF ₃	Cl	Et	H	Me	CF ₃	Cl	CH ₂ OH	H	Me
CF ₃	Cl	Et	H	Et	CF ₃	Cl	CH ₂ OH	H	Et
CF ₃	Cl	Et	H	i-Pr	CF ₃	Cl	CH ₂ OH	H	i-Pr
CF ₃	Cl	Et	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Cl	CH ₂ OH	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Et	Me	H	CF ₃	Cl	CH ₂ OH	Me	H
CF ₃	Cl	Et	Me	Me	CF ₃	Cl	CH ₂ OH	Me	Me
CF ₃	Cl	Et	Me	Et	CF ₃	Cl	CH ₂ OH	Me	Et
CF ₃	Cl	Et	Me	i-Pr	CF ₃	Cl	CH ₂ OH	Me	i-Pr
CF ₃	Cl	Et	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Cl	CH ₂ OH	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	i-Pr	H	H	CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	H	H
CF ₃	Cl	i-Pr	H	Me	CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	H	Me
CF ₃	Cl	i-Pr	H	Et	CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	H	Et
CF ₃	Cl	i-Pr	H	i-Pr	CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	H	i-Pr
CF ₃	Cl	i-Pr	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	i-Pr	Me	H	CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	Me	H
CF ₃	Cl	i-Pr	Me	Me	CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	Me	Me
CF ₃	Cl	i-Pr	Me	Et	CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	Me	Et
CF ₃	Cl	i-Pr	Me	i-Pr	CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	Me	i-Pr
CF ₃	Cl	i-Pr	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	Me	CH ₂ CF ₃

【0244】表1-2



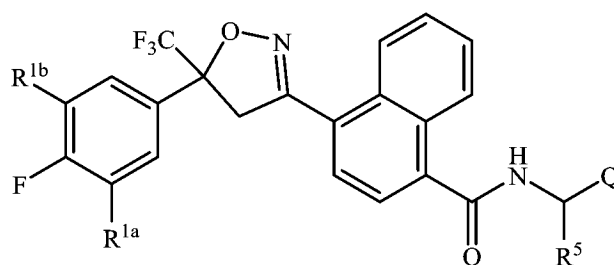
R ^{1a}	R ^{1b}	R ²	R ³	R ⁴	R ^{1a}	R ^{1b}	R ²	R ³	R ⁴
Cl	Cl	Me	H	H	CF ₃	H	Me	H	H
Cl	Cl	Cl	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me
Cl	Cl	Me	H	Et	CF ₃	H	Me	H	Et

第 45 頁，共 128 頁(發明說明書)

Cl	Cl	Me	H	i-Pr		CF ₃	H	Me	H	i-Pr
Cl	Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	Me	Me	H		CF ₃	H	Me	Me	H
Cl	Cl	Me	Me	Me		CF ₃	H	Me	Me	Me
Cl	Cl	Me	Me	Et		CF ₃	H	Me	Me	Et
Cl	Cl	Me	Me	i-Pr		CF ₃	H	Me	Me	i-Pr
Cl	Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	Et	H	H		CF ₃	H	Et	H	H
Cl	Cl	Et	H	Me		CF ₃	H	Et	H	Me
Cl	Cl	Et	H	Et		CF ₃	H	Et	H	Et
Cl	Cl	Et	H	i-Pr		CF ₃	H	Et	H	i-Pr
Cl	Cl	Et	H	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	Et	H	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	Et	Me	H		CF ₃	H	Et	Me	H
Cl	Cl	Et	Me	Me		CF ₃	H	Et	Me	Me
Cl	Cl	Et	Me	Et		CF ₃	H	Et	Me	Et
Cl	Cl	Et	Me	i-Pr		CF ₃	H	Et	Me	i-Pr
Cl	Cl	Et	Me	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	Et	Me	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	i-Pr	H	H		CF ₃	H	i-Pr	H	H
Cl	Cl	i-Pr	H	Me		CF ₃	H	i-Pr	H	Me
Cl	Cl	i-Pr	H	Et		CF ₃	H	i-Pr	H	Et
Cl	Cl	i-Pr	H	i-Pr		CF ₃	H	i-Pr	H	i-Pr
Cl	Cl	i-Pr	H	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	i-Pr	H	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	i-Pr	Me	H		CF ₃	H	i-Pr	Me	H
Cl	Cl	i-Pr	Me	Me		CF ₃	H	i-Pr	Me	Me
Cl	Cl	i-Pr	Me	Et		CF ₃	H	i-Pr	Me	Et
Cl	Cl	i-Pr	Me	i-Pr		CF ₃	H	i-Pr	Me	i-Pr
Cl	Cl	i-Pr	Me	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	i-Pr	Me	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	i-Bu	H	H		CF ₃	H	i-Bu	H	H
Cl	Cl	i-Bu	H	Me		CF ₃	H	i-Bu	H	Me
Cl	Cl	i-Bu	H	Et		CF ₃	H	i-Bu	H	Et
Cl	Cl	i-Bu	H	i-Pr		CF ₃	H	i-Bu	H	i-Pr
Cl	Cl	i-Bu	H	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	i-Bu	H	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	i-Bu	Me	H		CF ₃	H	i-Bu	Me	H
Cl	Cl	i-Bu	Me	Me		CF ₃	H	i-Bu	Me	Me
Cl	Cl	i-Bu	Me	Et		CF ₃	H	i-Bu	Me	Et
Cl	Cl	i-Bu	Me	i-Pr		CF ₃	H	i-Bu	Me	i-Pr
Cl	Cl	i-Bu	Me	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	i-Bu	Me	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	CH ₂ OH	H	H		CF ₃	H	CH ₂ OH	H	H
Cl	Cl	CH ₂ OH	H	Me		CF ₃	H	CH ₂ OH	H	Me
Cl	Cl	CH ₂ OH	H	Et		CF ₃	H	CH ₂ OH	H	Et
Cl	Cl	CH ₂ OH	H	i-Pr		CF ₃	H	CH ₂ OH	H	i-Pr
Cl	Cl	CH ₂ OH	H	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	CH ₂ OH	H	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	CH ₂ OH	Me	H		CF ₃	H	CH ₂ OH	Me	H
Cl	Cl	CH ₂ OH	Me	Me		CF ₃	H	CH ₂ OH	Me	Me
Cl	Cl	CH ₂ OH	Me	Et		CF ₃	H	CH ₂ OH	Me	Et
Cl	Cl	CH ₂ OH	Me	i-Pr		CF ₃	H	CH ₂ OH	Me	i-Pr
Cl	Cl	CH ₂ OH	Me	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	CH ₂ OH	Me	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	CH ₂ OMe	H	H		CF ₃	H	CH ₂ OMe	H	H
Cl	Cl	CH ₂ OMe	H	Me		CF ₃	H	CH ₂ OMe	H	Me
Cl	Cl	CH ₂ OMe	H	Et		CF ₃	H	CH ₂ OMe	H	Et

Cl	Cl	CH ₂ OMe	H	i-Pr		CF ₃	H	CH ₂ OMe	H	i-Pr
Cl	Cl	CH ₂ OMe	H	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	CH ₂ OMe	H	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	CH ₂ OMe	Me	H		CF ₃	H	CH ₂ OMe	Me	H
Cl	Cl	CH ₂ OMe	Me	Me		CF ₃	H	CH ₂ OMe	Me	Me
Cl	Cl	CH ₂ OMe	Me	Et		CF ₃	H	CH ₂ OMe	Me	Et
Cl	Cl	CH ₂ OMe	Me	i-Pr		CF ₃	H	CH ₂ OMe	Me	i-Pr
Cl	Cl	CH ₂ OMe	Me	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	CH ₂ OMe	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Me	H	H		CF ₃	Cl	i-Bu	H	H
CF ₃	Cl	Me	H	Me		CF ₃	Cl	i-Bu	H	Me
CF ₃	Cl	Me	H	Et		CF ₃	Cl	i-Bu	H	Et
CF ₃	Cl	Me	H	i-Pr		CF ₃	Cl	i-Bu	H	i-Pr
CF ₃	Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃		CF ₃	Cl	i-Bu	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Me	Me	H		CF ₃	Cl	i-Bu	Me	H
CF ₃	Cl	Me	Me	Me		CF ₃	Cl	i-Bu	Me	Me
CF ₃	Cl	Me	Me	Et		CF ₃	Cl	i-Bu	Me	Et
CF ₃	Cl	Me	Me	i-Pr		CF ₃	Cl	i-Bu	Me	i-Pr
CF ₃	Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃		CF ₃	Cl	i-Bu	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Et	H	H		CF ₃	Cl	CH ₂ OH	H	H
CF ₃	Cl	Et	H	Me		CF ₃	Cl	CH ₂ OH	H	Me
CF ₃	Cl	Et	H	Et		CF ₃	Cl	CH ₂ OH	H	Et
CF ₃	Cl	Et	H	i-Pr		CF ₃	Cl	CH ₂ OH	H	i-Pr
CF ₃	Cl	Et	H	CH ₂ CF ₃		CF ₃	Cl	CH ₂ OH	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Et	Me	H		CF ₃	Cl	CH ₂ OH	Me	H
CF ₃	Cl	Et	Me	Me		CF ₃	Cl	CH ₂ OH	Me	Me
CF ₃	Cl	Et	Me	Et		CF ₃	Cl	CH ₂ OH	Me	Et
CF ₃	Cl	Et	Me	i-Pr		CF ₃	Cl	CH ₂ OH	Me	i-Pr
CF ₃	Cl	Et	Me	CH ₂ CF ₃		CF ₃	Cl	CH ₂ OH	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	i-Pr	H	H		CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	H	H
CF ₃	Cl	i-Pr	H	Me		CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	H	Me
CF ₃	Cl	i-Pr	H	Et		CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	H	Et
CF ₃	Cl	i-Pr	H	i-Pr		CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	H	i-Pr
CF ₃	Cl	i-Pr	H	CH ₂ CF ₃		CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	i-Pr	Me	H		CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	Me	H
CF ₃	Cl	i-Pr	Me	Me		CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	Me	Me
CF ₃	Cl	i-Pr	Me	Et		CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	Me	Et
CF ₃	Cl	i-Pr	Me	i-Pr		CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	Me	i-Pr
CF ₃	Cl	i-Pr	Me	CH ₂ CF ₃		CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	Me	CH ₂ CF ₃

【0245】表2-1

【0246】R^{1a}為Cl，R^{1b}為Cl，R⁵為H

Q	Q	Q	Q
---	---	---	---

2-吡啶基	3-吡啶基	4-吡啶基	2-嘧啶基
4-嘧啶基	5-嘧啶基	2-吡嗪基	3-吡嗪基
3-噻嗪基	4-噻嗪基	3-(1,2,4-三嗪基)	5-(1,2,4-三嗪基)
6-(1,2,4-三嗪基)	2-(1,3,5-三嗪基)	2-呋喃基	3-呋喃基
2-噁吩基	3-噁吩基	2-吡咯基	3-吡咯基
1-甲基-2-吡咯基	1-甲基-3-吡咯基	3-吡唑基	4-吡唑基
5-吡唑基	1-甲基-3-吡唑基	1-甲基-4-吡唑基	1-甲基-5-吡唑基
2-咪唑基	4-咪唑基	1-甲基-2-咪唑基	1-甲基-4-咪唑基
1-甲基-5-咪唑基	1,2,3-三唑基	1-甲基-4-(1,2,3-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,3-三唑基)
1,2,4-三唑基	1-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
2-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	4-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	四唑基	1-甲基-5-(四唑基)
2-甲基-5-(四唑基)	2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基
2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基	3-異噁唑基
4-異噁唑基	5-異噁唑基	3-異噁唑基	4-異噁唑基
5-異噁唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)	3-(1,2,4-噁二唑基)
5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)
3-(1,2,4-噁二唑基)	5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	

【0247】 R^{1a}為CF₃，R^{1b}為H，R⁵為H

Q	Q	Q	Q
2-吡啶基	3-吡啶基	4-吡啶基	2-嘧啶基
4-嘧啶基	5-嘧啶基	2-吡嗪基	3-吡嗪基
3-噻嗪基	4-噻嗪基	3-(1,2,4-三嗪基)	5-(1,2,4-三嗪基)
6-(1,2,4-三嗪基)	2-(1,3,5-三嗪基)	2-呋喃基	3-呋喃基
2-噁吩基	3-噁吩基	2-吡咯基	3-吡咯基
1-甲基-2-吡咯基	1-甲基-3-吡咯基	3-吡唑基	4-吡唑基
5-吡唑基	1-甲基-3-吡唑基	1-甲基-4-吡唑基	1-甲基-5-吡唑基
2-咪唑基	4-咪唑基	1-甲基-2-咪唑基	1-甲基-4-咪唑基
1-甲基-5-咪唑基	1,2,3-三唑基	1-甲基-4-(1,2,3-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,3-三唑基)
1,2,4-三唑基	1-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
2-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	4-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	四唑基	1-甲基-5-(四唑基)
2-甲基-5-(四唑基)	2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基
2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基	3-異噁唑基
4-異噁唑基	5-異噁唑基	3-異噁唑基	4-異噁唑基
5-異噁唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)	3-(1,2,4-噁二唑基)
5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)
3-(1,2,4-噁二唑基)	5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	

【0248】 R^{1a}為CF₃，R^{1b}為Cl，R⁵為H

Q	Q	Q	Q
2-吡啶基	3-吡啶基	4-吡啶基	2-嘧啶基
4-嘧啶基	5-嘧啶基	2-吡嗪基	3-吡嗪基
3-噻嗪基	4-噻嗪基	3-(1,2,4-三嗪基)	5-(1,2,4-三嗪基)
6-(1,2,4-三嗪基)	2-(1,3,5-三嗪基)	2-呋喃基	3-呋喃基
2-噁吩基	3-噁吩基	2-吡咯基	3-吡咯基
1-甲基-2-吡咯基	1-甲基-3-吡咯基	3-吡唑基	4-吡唑基
5-吡唑基	1-甲基-3-吡唑基	1-甲基-4-吡唑基	1-甲基-5-吡唑基
2-咪唑基	4-咪唑基	1-甲基-2-咪唑基	1-甲基-4-咪唑基

1-甲基-5-咪唑基	1,2,3-三唑基	1-甲基-4-(1,2,3-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,3-三唑基)
1,2,4-三唑基	1-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
2-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	4-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	四唑基	1-甲基-5-(四唑基)
2-甲基-5-(四唑基)	2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基
2-噻唑基	4-噻唑基	5-噻唑基	3-異噁唑基
4-異噁唑基	5-異噁唑基	3-異噻唑基	4-異噻唑基
5-異噻唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)	3-(1,2,4-噁二唑基)
5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	4-(1,2,3-噻二唑基)	5-(1,2,3-噻二唑基)
3-(1,2,4-噻二唑基)	5-(1,2,4-噻二唑基)	1,3,4-噻二唑基	

【0249】 R^{1a}為Cl，R^{1b}為Cl，R⁵為甲基

Q	Q	Q	Q
2-吡啶基	3-吡啶基	4-吡啶基	2-嘧啶基
4-嘧啶基	5-嘧啶基	2-吡嗪基	3-吡嗪基
3-噻嗪基	4-噻嗪基	3-(1,2,4-三嗪基)	5-(1,2,4-三嗪基)
6-(1,2,4-三嗪基)	2-(1,3,5-三嗪基)	2-呋喃基	3-呋喃基
2-噻吩基	3-噻吩基	2-吡咯基	3-吡咯基
1-甲基-2-吡咯基	1-甲基-3-吡咯基	3-吡唑基	4-吡唑基
5-吡唑基	1-甲基-3-吡唑基	1-甲基-4-吡唑基	1-甲基-5-吡唑基
2-咪唑基	4-咪唑基	1-甲基-2-咪唑基	1-甲基-4-咪唑基
1-甲基-5-咪唑基	1,2,3-三唑基	1-甲基-4-(1,2,3-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,3-三唑基)
1,2,4-三唑基	1-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
2-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	4-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	四唑基	1-甲基-5-(四唑基)
2-甲基-5-(四唑基)	2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基
2-噻唑基	4-噻唑基	5-噻唑基	3-異噁唑基
4-異噁唑基	5-異噁唑基	3-異噻唑基	4-異噻唑基
5-異噻唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)	3-(1,2,4-噁二唑基)
5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	4-(1,2,3-噻二唑基)	5-(1,2,3-噻二唑基)
3-(1,2,4-噻二唑基)	5-(1,2,4-噻二唑基)	1,3,4-噻二唑基	

【0250】 R^{1a}為CF₃，R^{1b}為H，R⁵為甲基

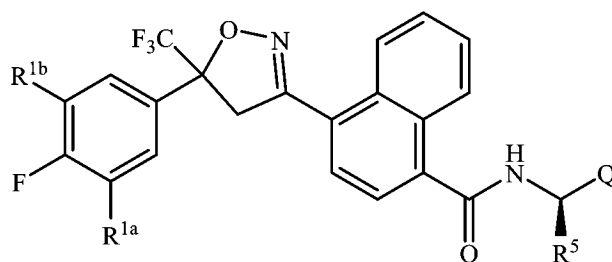
Q	Q	Q	Q
2-吡啶基	3-吡啶基	4-吡啶基	2-嘧啶基
4-嘧啶基	5-嘧啶基	2-吡嗪基	3-吡嗪基
3-噻嗪基	4-噻嗪基	3-(1,2,4-三嗪基)	5-(1,2,4-三嗪基)
6-(1,2,4-三嗪基)	2-(1,3,5-三嗪基)	2-呋喃基	3-呋喃基
2-噻吩基	3-噻吩基	2-吡咯基	3-吡咯基
1-甲基-2-吡咯基	1-甲基-3-吡咯基	3-吡唑基	4-吡唑基
5-吡唑基	1-甲基-3-吡唑基	1-甲基-4-吡唑基	1-甲基-5-吡唑基
2-咪唑基	4-咪唑基	1-甲基-2-咪唑基	1-甲基-4-咪唑基
1-甲基-5-咪唑基	1,2,3-三唑基	1-甲基-4-(1,2,3-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,3-三唑基)
1,2,4-三唑基	1-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
2-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	4-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	四唑基	1-甲基-5-(四唑基)
2-甲基-5-(四唑基)	2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基
2-噻唑基	4-噻唑基	5-噻唑基	3-異噁唑基
4-異噁唑基	5-異噁唑基	3-異噻唑基	4-異噻唑基
5-異噻唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)	3-(1,2,4-噁二唑基)
5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	4-(1,2,3-噻二唑基)	5-(1,2,3-噻二唑基)

3-(1,2,4-噁二唑基)	5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	
----------------	----------------	------------	--

【0251】 R^{1a}為CF₃，R^{1b}為Cl，R⁵為甲基

Q	Q	Q	Q
2-吡啶基	3-吡啶基	4-吡啶基	2-嘧啶基
4-嘧啶基	5-嘧啶基	2-吡嗪基	3-吡嗪基
3-噻嗪基	4-噻嗪基	3-(1,2,4-三嗪基)	5-(1,2,4-三嗪基)
6-(1,2,4-三嗪基)	2-(1,3,5-三嗪基)	2-呋喃基	3-呋喃基
2-噁吩基	3-噁吩基	2-吡咯基	3-吡咯基
1-甲基-2-吡咯基	1-甲基-3-吡咯基	3-吡唑基	4-吡唑基
5-吡唑基	1-甲基-3-吡唑基	1-甲基-4-吡唑基	1-甲基-5-吡唑基
2-咪唑基	4-咪唑基	1-甲基-2-咪唑基	1-甲基-4-咪唑基
1-甲基-5-咪唑基	1,2,3-三唑基	1-甲基-4-(1,2,3-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,3-三唑基)
1,2,4-三唑基	1-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
2-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	4-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	四唑基	1-甲基-5-(四唑基)
2-甲基-5-(四唑基)	2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基
2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基	3-異噁唑基
4-異噁唑基	5-異噁唑基	3-異噁唑基	4-異噁唑基
5-異噁唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)	3-(1,2,4-噁二唑基)
5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)
3-(1,2,4-噁二唑基)	5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	

【0252】 表2-2



【0253】 R^{1a}為Cl，R^{1b}為Cl，R⁵為甲基

Q	Q	Q	Q
2-吡啶基	3-吡啶基	4-吡啶基	2-嘧啶基
4-嘧啶基	5-嘧啶基	2-吡嗪基	3-吡嗪基
3-噻嗪基	4-噻嗪基	3-(1,2,4-三嗪基)	5-(1,2,4-三嗪基)
6-(1,2,4-三嗪基)	2-(1,3,5-三嗪基)	2-呋喃基	3-呋喃基
2-噁吩基	3-噁吩基	2-吡咯基	3-吡咯基
1-甲基-2-吡咯基	1-甲基-3-吡咯基	3-吡唑基	4-吡唑基
5-吡唑基	1-甲基-3-吡唑基	1-甲基-4-吡唑基	1-甲基-5-吡唑基
2-咪唑基	4-咪唑基	1-甲基-2-咪唑基	1-甲基-4-咪唑基
1-甲基-5-咪唑基	1,2,3-三唑基	1-甲基-4-(1,2,3-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,3-三唑基)
1,2,4-三唑基	1-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
2-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	4-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	四唑基	1-甲基-5-(四唑基)
2-甲基-5-(四唑基)	2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基
2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基	3-異噁唑基
4-異噁唑基	5-異噁唑基	3-異噁唑基	4-異噁唑基
5-異噁唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)	3-(1,2,4-噁二唑基)

5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	4-(1,2,3-噻二唑基)	5-(1,2,3-噻二唑基)
3-(1,2,4-噻二唑基)	5-(1,2,4-噻二唑基)	1,3,4-噻二唑基	

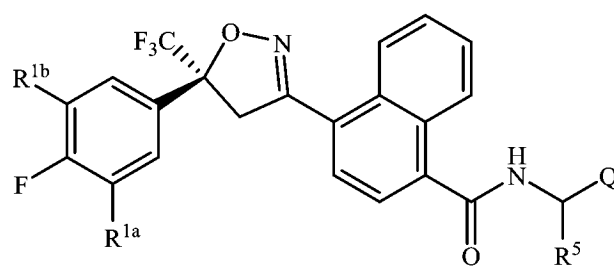
【0254】 R^{1a}為CF₃，R^{1b}為H，R⁵為甲基

Q	Q	Q	Q
2-吡啶基	3-吡啶基	4-吡啶基	2-嘧啶基
4-嘧啶基	5-嘧啶基	2-吡嗪基	3-吡嗪基
3-噻嗪基	4-噻嗪基	3-(1,2,4-三嗪基)	5-(1,2,4-三嗪基)
6-(1,2,4-三嗪基)	2-(1,3,5-三嗪基)	2-呋喃基	3-呋喃基
2-噁吩基	3-噁吩基	2-吡咯基	3-吡咯基
1-甲基-2-吡咯基	1-甲基-3-吡咯基	3-吡唑基	4-吡唑基
5-吡唑基	1-甲基-3-吡唑基	1-甲基-4-吡唑基	1-甲基-5-吡唑基
2-咪唑基	4-咪唑基	1-甲基-2-咪唑基	1-甲基-4-咪唑基
1-甲基-5-咪唑基	1,2,3-三唑基	1-甲基-4-(1,2,3-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,3-三唑基)
1,2,4-三唑基	1-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
2-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	4-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	四唑基	1-甲基-5-(四唑基)
2-甲基-5-(四唑基)	2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基
2-噻唑基	4-噻唑基	5-噻唑基	3-異噁唑基
4-異噁唑基	5-異噁唑基	3-異噻唑基	4-異噻唑基
5-異噻唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)	3-(1,2,4-噁二唑基)
5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	4-(1,2,3-噻二唑基)	5-(1,2,3-噻二唑基)
3-(1,2,4-噻二唑基)	5-(1,2,4-噻二唑基)	1,3,4-噻二唑基	

【0255】 R^{1a}為CF₃，R^{1b}為Cl，R⁵為甲基

Q	Q	Q	Q
2-吡啶基	3-吡啶基	4-吡啶基	2-嘧啶基
4-嘧啶基	5-嘧啶基	2-吡嗪基	3-吡嗪基
3-噻嗪基	4-噻嗪基	3-(1,2,4-三嗪基)	5-(1,2,4-三嗪基)
6-(1,2,4-三嗪基)	2-(1,3,5-三嗪基)	2-呋喃基	3-呋喃基
2-噁吩基	3-噁吩基	2-吡咯基	3-吡咯基
1-甲基-2-吡咯基	1-甲基-3-吡咯基	3-吡唑基	4-吡唑基
5-吡唑基	1-甲基-3-吡唑基	1-甲基-4-吡唑基	1-甲基-5-吡唑基
2-咪唑基	4-咪唑基	1-甲基-2-咪唑基	1-甲基-4-咪唑基
1-甲基-5-咪唑基	1,2,3-三唑基	1-甲基-4-(1,2,3-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,3-三唑基)
1,2,4-三唑基	1-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
2-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	4-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	四唑基	1-甲基-5-(四唑基)
2-甲基-5-(四唑基)	2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基
2-噻唑基	4-噻唑基	5-噻唑基	3-異噁唑基
4-異噁唑基	5-異噁唑基	3-異噻唑基	4-異噻唑基
5-異噻唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)	3-(1,2,4-噁二唑基)
5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	4-(1,2,3-噻二唑基)	5-(1,2,3-噻二唑基)
3-(1,2,4-噻二唑基)	5-(1,2,4-噻二唑基)	1,3,4-噻二唑基	

【0256】 表2-3



【0257】 R^{1a}為Cl，R^{1b}為Cl，R⁵為H

Q	Q	Q	Q
2-吡啶基	3-吡啶基	4-吡啶基	2-嘧啶基
4-嘧啶基	5-嘧啶基	2-吡嗪基	3-吡嗪基
3-噻嗪基	4-噻嗪基	3-(1,2,4-三嗪基)	5-(1,2,4-三嗪基)
6-(1,2,4-三嗪基)	2-(1,3,5-三嗪基)	2-呋喃基	3-呋喃基
2-噁吩基	3-噁吩基	2-吡咯基	3-吡咯基
1-甲基-2-吡咯基	1-甲基-3-吡咯基	3-吡唑基	4-吡唑基
5-吡唑基	1-甲基-3-吡唑基	1-甲基-4-吡唑基	1-甲基-5-吡唑基
2-咪唑基	4-咪唑基	1-甲基-2-咪唑基	1-甲基-4-咪唑基
1-甲基-5-咪唑基	1,2,3-三唑基	1-甲基-4-(1,2,3-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,3-三唑基)
1,2,4-三唑基	1-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
2-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	4-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	四唑基	1-甲基-5-(四唑基)
2-甲基-5-(四唑基)	2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基
2-噻唑基	4-噻唑基	5-噻唑基	3-異噁唑基
4-異噁唑基	5-異噁唑基	3-異噻唑基	4-異噻唑基
5-異噻唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)	3-(1,2,4-噁二唑基)
5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	4-(1,2,3-噻二唑基)	5-(1,2,3-噻二唑基)
3-(1,2,4-噻二唑基)	5-(1,2,4-噻二唑基)	1,3,4-噻二唑基	

【0258】 R^{1a}為CF₃，R^{1b}為H，R⁵為H

Q	Q	Q	Q
2-吡啶基	3-吡啶基	4-吡啶基	2-嘧啶基
4-嘧啶基	5-嘧啶基	2-吡嗪基	3-吡嗪基
3-噻嗪基	4-噻嗪基	3-(1,2,4-三嗪基)	5-(1,2,4-三嗪基)
6-(1,2,4-三嗪基)	2-(1,3,5-三嗪基)	2-呋喃基	3-呋喃基
2-噁吩基	3-噁吩基	2-吡咯基	3-吡咯基
1-甲基-2-吡咯基	1-甲基-3-吡咯基	3-吡唑基	4-吡唑基
5-吡唑基	1-甲基-3-吡唑基	1-甲基-4-吡唑基	1-甲基-5-吡唑基
2-咪唑基	4-咪唑基	1-甲基-2-咪唑基	1-甲基-4-咪唑基
1-甲基-5-咪唑基	1,2,3-三唑基	1-甲基-4-(1,2,3-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,3-三唑基)
1,2,4-三唑基	1-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
2-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	4-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	四唑基	1-甲基-5-(四唑基)
2-甲基-5-(四唑基)	2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基
2-噻唑基	4-噻唑基	5-噻唑基	3-異噁唑基
4-異噁唑基	5-異噁唑基	3-異噻唑基	4-異噻唑基
5-異噻唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)	3-(1,2,4-噁二唑基)
5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	4-(1,2,3-噻二唑基)	5-(1,2,3-噻二唑基)
3-(1,2,4-噻二唑基)	5-(1,2,4-噻二唑基)	1,3,4-噻二唑基	

【0259】 R^{1a}為CF₃，R^{1b}為Cl，R⁵為H

第 52 頁，共 128 頁(發明說明書)

Q	Q	Q	Q
2-吡啶基	3-吡啶基	4-吡啶基	2-嘧啶基
4-嘧啶基	5-嘧啶基	2-吡嗪基	3-吡嗪基
3-噻嗪基	4-噻嗪基	3-(1,2,4-三嗪基)	5-(1,2,4-三嗪基)
6-(1,2,4-三嗪基)	2-(1,3,5-三嗪基)	2-呋喃基	3-呋喃基
2-噁吩基	3-噁吩基	2-吡咯基	3-吡咯基
1-甲基-2-吡咯基	1-甲基-3-吡咯基	3-吡唑基	4-吡唑基
5-吡唑基	1-甲基-3-吡唑基	1-甲基-4-吡唑基	1-甲基-5-吡唑基
2-咪唑基	4-咪唑基	1-甲基-2-咪唑基	1-甲基-4-咪唑基
1-甲基-5-咪唑基	1,2,3-三唑基	1-甲基-4-(1,2,3-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,3-三唑基)
1,2,4-三唑基	1-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
2-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	4-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	四唑基	1-甲基-5-(四唑基)
2-甲基-5-(四唑基)	2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基
2-噻唑基	4-噻唑基	5-噻唑基	3-異噁唑基
4-異噁唑基	5-異噁唑基	3-異噻唑基	4-異噻唑基
5-異噻唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)	3-(1,2,4-噁二唑基)
5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	4-(1,2,3-噻二唑基)	5-(1,2,3-噻二唑基)
3-(1,2,4-噻二唑基)	5-(1,2,4-噻二唑基)	1,3,4-噻二唑基	

【0260】 R^{1a}為Cl，R^{1b}為Cl，R⁵為甲基

Q	Q	Q	Q
2-吡啶基	3-吡啶基	4-吡啶基	2-嘧啶基
4-嘧啶基	5-嘧啶基	2-吡嗪基	3-吡嗪基
3-噻嗪基	4-噻嗪基	3-(1,2,4-三嗪基)	5-(1,2,4-三嗪基)
6-(1,2,4-三嗪基)	2-(1,3,5-三嗪基)	2-呋喃基	3-呋喃基
2-噁吩基	3-噁吩基	2-吡咯基	3-吡咯基
1-甲基-2-吡咯基	1-甲基-3-吡咯基	3-吡唑基	4-吡唑基
5-吡唑基	1-甲基-3-吡唑基	1-甲基-4-吡唑基	1-甲基-5-吡唑基
2-咪唑基	4-咪唑基	1-甲基-2-咪唑基	1-甲基-4-咪唑基
1-甲基-5-咪唑基	1,2,3-三唑基	1-甲基-4-(1,2,3-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,3-三唑基)
1,2,4-三唑基	1-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
2-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	4-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	四唑基	1-甲基-5-(四唑基)
2-甲基-5-(四唑基)	2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基
2-噻唑基	4-噻唑基	5-噻唑基	3-異噁唑基
4-異噁唑基	5-異噁唑基	3-異噻唑基	4-異噻唑基
5-異噻唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)	3-(1,2,4-噁二唑基)
5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	4-(1,2,3-噻二唑基)	5-(1,2,3-噻二唑基)
3-(1,2,4-噻二唑基)	5-(1,2,4-噻二唑基)	1,3,4-噻二唑基	

【0261】 R^{1a}為CF₃，R^{1b}為H，R⁵為甲基

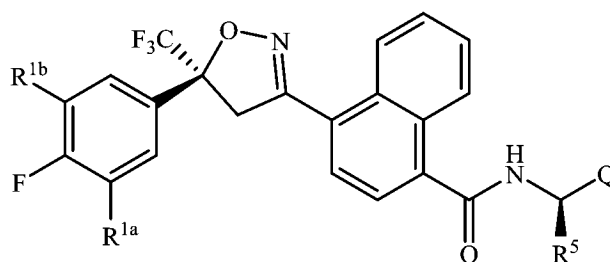
Q	Q	Q	Q
2-吡啶基	3-吡啶基	4-吡啶基	2-嘧啶基
4-嘧啶基	5-嘧啶基	2-吡嗪基	3-吡嗪基
3-噻嗪基	4-噻嗪基	3-(1,2,4-三嗪基)	5-(1,2,4-三嗪基)
6-(1,2,4-三嗪基)	2-(1,3,5-三嗪基)	2-呋喃基	3-呋喃基
2-噁吩基	3-噁吩基	2-吡咯基	3-吡咯基
1-甲基-2-吡咯基	1-甲基-3-吡咯基	3-吡唑基	4-吡唑基
5-吡唑基	1-甲基-3-吡唑基	1-甲基-4-吡唑基	1-甲基-5-吡唑基

2-咪唑基	4-咪唑基	1-甲基-2-咪唑基	1-甲基-4-咪唑基
1-甲基-5-咪唑基	1,2,3-三唑基	1-甲基-4-(1,2,3-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,3-三唑基)
1,2,4-三唑基	1-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
2-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	4-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	四唑基	1-甲基-5-(四唑基)
2-甲基-5-(四唑基)	2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基
2-噻唑基	4-噻唑基	5-噻唑基	3-異噁唑基
4-異噁唑基	5-異噁唑基	3-異噻唑基	4-異噻唑基
5-異噻唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)	3-(1,2,4-噁二唑基)
5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	4-(1,2,3-噻二唑基)	5-(1,2,3-噻二唑基)
3-(1,2,4-噻二唑基)	5-(1,2,4-噻二唑基)	1,3,4-噻二唑基	

【0262】 R^{1a}為CF₃，R^{1b}為Cl，R⁵為甲基

Q	Q	Q	Q
2-吡啶基	3-吡啶基	4-吡啶基	2-嘧啶基
4-嘧啶基	5-嘧啶基	2-吡嗪基	3-吡嗪基
3-噻嗪基	4-噻嗪基	3-(1,2,4-三嗪基)	5-(1,2,4-三嗪基)
6-(1,2,4-三嗪基)	2-(1,3,5-三嗪基)	2-呋喃基	3-呋喃基
2-噻吩基	3-噻吩基	2-吡咯基	3-吡咯基
1-甲基-2-吡咯基	1-甲基-3-吡咯基	3-吡唑基	4-吡唑基
5-吡唑基	1-甲基-3-吡唑基	1-甲基-4-吡唑基	1-甲基-5-吡唑基
2-咪唑基	4-咪唑基	1-甲基-2-咪唑基	1-甲基-4-咪唑基
1-甲基-5-咪唑基	1,2,3-三唑基	1-甲基-4-(1,2,3-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,3-三唑基)
1,2,4-三唑基	1-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
2-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	4-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	四唑基	1-甲基-5-(四唑基)
2-甲基-5-(四唑基)	2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基
2-噻唑基	4-噻唑基	5-噻唑基	3-異噁唑基
4-異噁唑基	5-異噁唑基	3-異噻唑基	4-異噻唑基
5-異噻唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)	3-(1,2,4-噁二唑基)
5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	4-(1,2,3-噻二唑基)	5-(1,2,3-噻二唑基)
3-(1,2,4-噻二唑基)	5-(1,2,4-噻二唑基)	1,3,4-噻二唑基	

【0263】 表2-4



【0264】 R^{1a}為Cl，R^{1b}為Cl，R⁵為甲基

Q	Q	Q	Q
2-吡啶基	3-吡啶基	4-吡啶基	2-嘧啶基
4-嘧啶基	5-嘧啶基	2-吡嗪基	3-吡嗪基
3-噻嗪基	4-噻嗪基	3-(1,2,4-三嗪基)	5-(1,2,4-三嗪基)
6-(1,2,4-三嗪基)	2-(1,3,5-三嗪基)	2-呋喃基	3-呋喃基
2-噻吩基	3-噻吩基	2-吡咯基	3-吡咯基
1-甲基-2-吡咯基	1-甲基-3-吡咯基	3-吡唑基	4-吡唑基

5-吡啶基	1-甲基-3-吡啶基	1-甲基-4-吡啶基	1-甲基-5-吡啶基
2-咪唑基	4-咪唑基	1-甲基-2-咪唑基	1-甲基-4-咪唑基
1-甲基-5-咪唑基	1,2,3-三唑基	1-甲基-4-(1,2,3-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,3-三唑基)
1,2,4-三唑基	1-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
2-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	4-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	四唑基	1-甲基-5-(四唑基)
2-噁唑基	2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基
2-噻唑基	4-噻唑基	5-噻唑基	3-異噁唑基
4-異噁唑基	5-異噁唑基	3-異噻唑基	4-異噻唑基
5-異噻唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)	3-(1,2,4-噁二唑基)
5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	4-(1,2,3-噻二唑基)	5-(1,2,3-噻二唑基)
3-(1,2,4-噻二唑基)	5-(1,2,4-噻二唑基)	1,3,4-噻二唑基	

【0265】 R^{1a}為CF₃，R^{1b}為H，R⁵為甲基

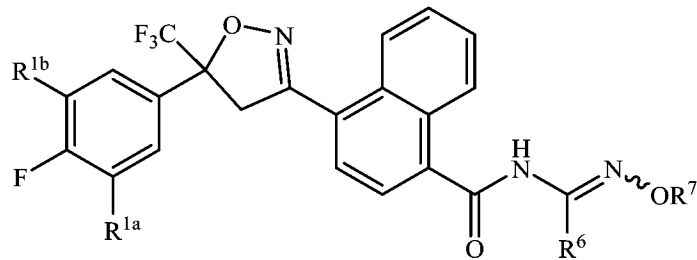
Q	Q	Q	Q
2-吡啶基	3-吡啶基	4-吡啶基	2-嘧啶基
4-嘧啶基	5-嘧啶基	2-吡嗪基	3-吡嗪基
3-噻嗪基	4-噻嗪基	3-(1,2,4-三嗪基)	5-(1,2,4-三嗪基)
6-(1,2,4-三嗪基)	2-(1,3,5-三嗪基)	2-呋喃基	3-呋喃基
2-噁吩基	3-噁吩基	2-吡咯基	3-吡咯基
1-甲基-2-吡咯基	1-甲基-3-吡咯基	3-吡啶基	4-吡啶基
5-吡啶基	1-甲基-3-吡啶基	1-甲基-4-吡啶基	1-甲基-5-吡啶基
2-咪唑基	4-咪唑基	1-甲基-2-咪唑基	1-甲基-4-咪唑基
1-甲基-5-咪唑基	1,2,3-三唑基	1-甲基-4-(1,2,3-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,3-三唑基)
1,2,4-三唑基	1-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
2-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	4-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	四唑基	1-甲基-5-(四唑基)
2-甲基-5-(四唑基)	2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基
2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基	3-異噁唑基
4-異噁唑基	5-異噁唑基	3-異噻唑基	4-異噻唑基
5-異噻唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)	3-(1,2,4-噁二唑基)
5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	4-(1,2,3-噻二唑基)	5-(1,2,3-噻二唑基)
3-(1,2,4-噻二唑基)	5-(1,2,4-噻二唑基)	1,3,4-噻二唑基	

【0266】 R^{1a}為CF₃，R^{1b}為Cl，R⁵為甲基

Q	Q	Q	Q
2-吡啶基	3-吡啶基	4-吡啶基	2-嘧啶基
4-嘧啶基	5-嘧啶基	2-吡嗪基	3-吡嗪基
3-噻嗪基	4-噻嗪基	3-(1,2,4-三嗪基)	5-(1,2,4-三嗪基)
6-(1,2,4-三嗪基)	2-(1,3,5-三嗪基)	2-呋喃基	3-呋喃基
2-噁吩基	3-噁吩基	2-吡咯基	3-吡咯基
1-甲基-2-吡咯基	1-甲基-3-吡咯基	3-吡啶基	4-吡啶基
5-吡啶基	1-甲基-3-吡啶基	1-甲基-4-吡啶基	1-甲基-5-吡啶基
2-咪唑基	4-咪唑基	1-甲基-2-咪唑基	1-甲基-4-咪唑基
1-甲基-5-咪唑基	1,2,3-三唑基	1-甲基-4-(1,2,3-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,3-三唑基)
1,2,4-三唑基	1-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	1-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
2-甲基-5-(1,2,4-三唑基)	4-甲基-3-(1,2,4-三唑基)	四唑基	1-甲基-5-(四唑基)
2-甲基-5-(四唑基)	2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基
2-噁唑基	4-噁唑基	5-噁唑基	3-異噁唑基
4-異噁唑基	5-異噁唑基	3-異噻唑基	4-異噻唑基

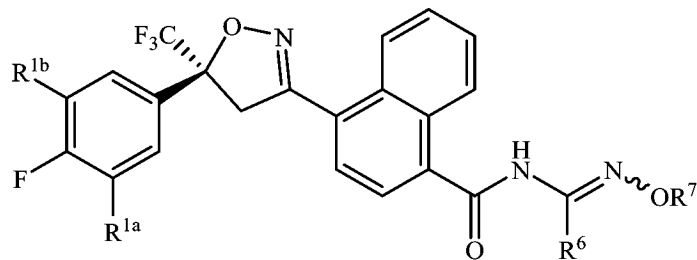
5-異噻唑基	4-(1,2,3-噁二唑基)	5-(1,2,3-噁二唑基)	3-(1,2,4-噁二唑基)
5-(1,2,4-噁二唑基)	1,3,4-噁二唑基	4-(1,2,3-噻二唑基)	5-(1,2,3-噻二唑基)
3-(1,2,4-噻二唑基)	5-(1,2,4-噻二唑基)	1,3,4-噻二唑基	

【0267】表3-1



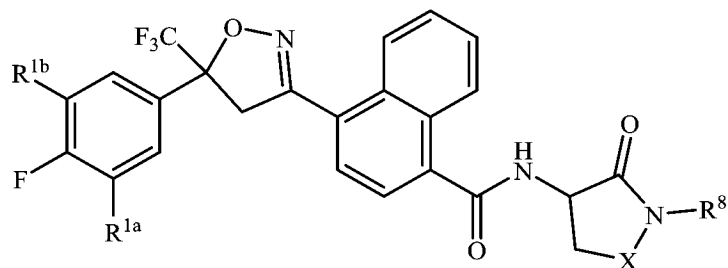
R ^{1a}	R ^{1b}	R ⁶	R ⁷	R ^{1a}	R ^{1b}	R ⁶	R ⁷
Cl	Cl	H	Me	CF ₃	H	H	Me
Cl	Cl	H	Et	CF ₃	H	H	Et
Cl	Cl	Me	Me	CF ₃	H	Me	Me
Cl	Cl	Me	Et	CF ₃	H	Me	Et
CF ₃	Cl	H	Me	CF ₃	Cl	Me	Me
CF ₃	Cl	H	Et	CF ₃	Cl	Me	Et

【0268】表3-2



R ^{1a}	R ^{1b}	R ⁶	R ⁷	R ^{1a}	R ^{1b}	R ⁶	R ⁷
Cl	Cl	H	Me	CF ₃	H	H	Me
Cl	Cl	H	Et	CF ₃	H	H	Et
Cl	Cl	Me	Me	CF ₃	H	Me	Me
Cl	Cl	Me	Et	CF ₃	H	Me	Et
CF ₃	Cl	H	Me	CF ₃	Cl	Me	Me
CF ₃	Cl	H	Et	CF ₃	Cl	Me	Et

【0269】表4-1



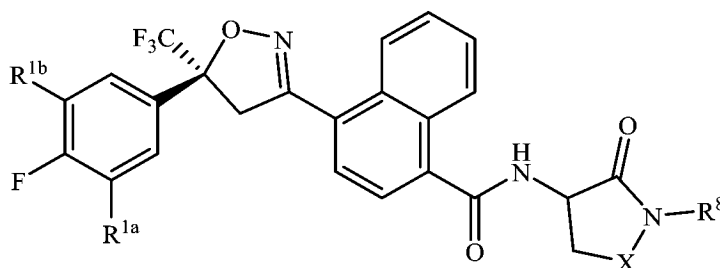
【0270】 X為-O-

R ^{1a}	R ^{1b}	R ⁸		R ^{1a}	R ^{1b}	R ⁸
Cl	Cl	Me		CF ₃	H	Me
Cl	Cl	Et		CF ₃	H	Et
Cl	Cl	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Me				
CF ₃	Cl	Et				
CF ₃	Cl	CH ₂ CF ₃				

【0271】 X為-C(O)-

R ^{1a}	R ^{1b}	R ⁸		R ^{1a}	R ^{1b}	R ⁸
Cl	Cl	Me		CF ₃	H	Me
Cl	Cl	Et		CF ₃	H	Et
Cl	Cl	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Me				
CF ₃	Cl	Et				
CF ₃	Cl	CH ₂ CF ₃				

【0272】 表4-2



【0273】 X為-O-

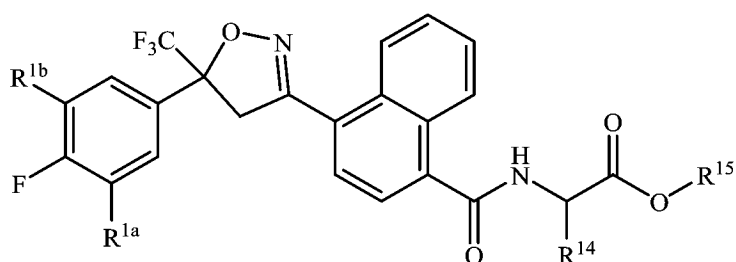
R ^{1a}	R ^{1b}	R ⁸		R ^{1a}	R ^{1b}	R ⁸
Cl	Cl	Me		CF ₃	H	Me
Cl	Cl	Et		CF ₃	H	Et
Cl	Cl	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Me				
CF ₃	Cl	Et				
CF ₃	Cl	CH ₂ CF ₃				

【0274】 X為-C(O)-

R ^{1a}	R ^{1b}	R ⁸		R ^{1a}	R ^{1b}	R ⁸
Cl	Cl	Me		CF ₃	H	Me
Cl	Cl	Et		CF ₃	H	Et
Cl	Cl	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Me				
CF ₃	Cl	Et				

CF ₃	Cl	CH ₂ CF ₃			
-----------------	----	---------------------------------	--	--	--

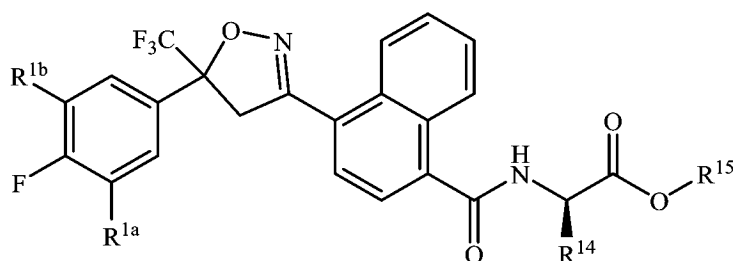
【0275】表5-1



R ^{1a}	R ^{1b}	R ¹⁴	R ¹⁵	R ^{1a}	R ^{1b}	R ¹⁴	R ¹⁵
Cl	Cl	Me	H	CF ₃	H	Me	H
Cl	Cl	Et	H	CF ₃	H	Et	H
Cl	Cl	i-Pr	H	CF ₃	H	i-Pr	H
Cl	Cl	i-Bu	H	CF ₃	H	i-Bu	H
Cl	Cl	CH ₂ OH	H	CF ₃	H	CH ₂ OH	H
Cl	Cl	CH ₂ OMe	H	CF ₃	H	CH ₂ OMe	H
Cl	Cl	Me	Me	CF ₃	H	Me	Me
Cl	Cl	Et	Me	CF ₃	H	Et	Me
Cl	Cl	i-Pr	Me	CF ₃	H	i-Pr	Me
Cl	Cl	i-Bu	Me	CF ₃	H	i-Bu	Me
Cl	Cl	CH ₂ OH	Me	CF ₃	H	CH ₂ OH	Me
Cl	Cl	CH ₂ OMe	Me	CF ₃	H	CH ₂ OMe	Me
Cl	Cl	Me	Et	CF ₃	H	Me	Et
Cl	Cl	Et	Et	CF ₃	H	Et	Et
Cl	Cl	i-Pr	Et	CF ₃	H	i-Pr	Et
Cl	Cl	i-Bu	Et	CF ₃	H	i-Bu	Et
Cl	Cl	CH ₂ OH	Et	CF ₃	H	CH ₂ OH	Et
Cl	Cl	CH ₂ OMe	Et	CF ₃	H	CH ₂ OMe	Et
Cl	Cl	Me	i-Pr	CF ₃	H	Me	i-Pr
Cl	Cl	Et	i-Pr	CF ₃	H	Et	i-Pr
Cl	Cl	i-Pr	i-Pr	CF ₃	H	i-Pr	i-Pr
Cl	Cl	i-Bu	i-Pr	CF ₃	H	i-Bu	i-Pr
Cl	Cl	CH ₂ OH	i-Pr	CF ₃	H	CH ₂ OH	i-Pr
Cl	Cl	CH ₂ OMe	i-Pr	CF ₃	H	CH ₂ OMe	i-Pr
Cl	Cl	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Me	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	Et	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Et	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	i-Pr	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	i-Pr	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	i-Bu	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	i-Bu	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	CH ₂ OH	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OH	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	CH ₂ OMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OMe	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Me	H	CF ₃	Cl	Me	i-Pr
CF ₃	Cl	Et	H	CF ₃	Cl	Et	i-Pr
CF ₃	Cl	i-Pr	H	CF ₃	Cl	i-Pr	i-Pr

CF ₃	Cl	i-Bu	H		CF ₃	Cl	i-Bu	i-Pr
CF ₃	Cl	CH ₂ OH	H		CF ₃	Cl	CH ₂ OH	i-Pr
CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	H		CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	i-Pr
CF ₃	Cl	Me	Me		CF ₃	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Et	Me		CF ₃	Cl	Et	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	i-Pr	Me		CF ₃	Cl	i-Pr	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	i-Bu	Me		CF ₃	Cl	i-Bu	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	CH ₂ OH	Me		CF ₃	Cl	CH ₂ OH	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	Me		CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Me	Et					
CF ₃	Cl	Et	Et					
CF ₃	Cl	i-Pr	Et					
CF ₃	Cl	i-Bu	Et					
CF ₃	Cl	CH ₂ OH	Et					
CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	Et					

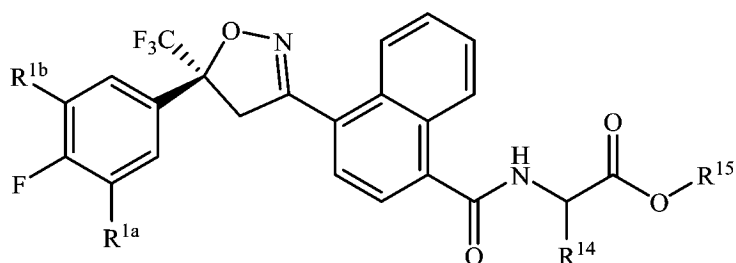
【0276】 表5-2



R ^{1a}	R ^{1b}	R ¹⁴	R ¹⁵		R ^{1a}	R ^{1b}	R ¹⁴	R ¹⁵
Cl	Cl	Me	H		CF ₃	H	Me	H
Cl	Cl	Et	H		CF ₃	H	Et	H
Cl	Cl	i-Pr	H		CF ₃	H	i-Pr	H
Cl	Cl	i-Bu	H		CF ₃	H	i-Bu	H
Cl	Cl	CH ₂ OH	H		CF ₃	H	CH ₂ OH	H
Cl	Cl	CH ₂ OMe	H		CF ₃	H	CH ₂ OMe	H
Cl	Cl	Me	Me		CF ₃	H	Me	Me
Cl	Cl	Et	Me		CF ₃	H	Et	Me
Cl	Cl	i-Pr	Me		CF ₃	H	i-Pr	Me
Cl	Cl	i-Bu	Me		CF ₃	H	i-Bu	Me
Cl	Cl	CH ₂ OH	Me		CF ₃	H	CH ₂ OH	Me
Cl	Cl	CH ₂ OMe	Me		CF ₃	H	CH ₂ OMe	Me
Cl	Cl	Me	Et		CF ₃	H	Me	Et
Cl	Cl	Et	Et		CF ₃	H	Et	Et
Cl	Cl	i-Pr	Et		CF ₃	H	i-Pr	Et
Cl	Cl	i-Bu	Et		CF ₃	H	i-Bu	Et
Cl	Cl	CH ₂ OH	Et		CF ₃	H	CH ₂ OH	Et
Cl	Cl	CH ₂ OMe	Et		CF ₃	H	CH ₂ OMe	Et
Cl	Cl	Me	i-Pr		CF ₃	H	Me	i-Pr

Cl	Cl	Et	i-Pr	CF ₃	H	Et	i-Pr
Cl	Cl	i-Pr	i-Pr	CF ₃	H	i-Pr	i-Pr
Cl	Cl	i-Bu	i-Pr	CF ₃	H	i-Bu	i-Pr
Cl	Cl	CH ₂ OH	i-Pr	CF ₃	H	CH ₂ OH	i-Pr
Cl	Cl	CH ₂ OMe	i-Pr	CF ₃	H	CH ₂ OMe	i-Pr
Cl	Cl	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Me	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	Et	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Et	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	i-Pr	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	i-Pr	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	i-Bu	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	i-Bu	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	CH ₂ OH	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OH	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	CH ₂ OMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OMe	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Me	H	CF ₃	Cl	Me	i-Pr
CF ₃	Cl	Et	H	CF ₃	Cl	Et	i-Pr
CF ₃	Cl	i-Pr	H	CF ₃	Cl	i-Pr	i-Pr
CF ₃	Cl	i-Bu	H	CF ₃	Cl	i-Bu	i-Pr
CF ₃	Cl	CH ₂ OH	H	CF ₃	Cl	CH ₂ OH	i-Pr
CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	H	CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	i-Pr
CF ₃	Cl	Me	Me	CF ₃	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Et	Me	CF ₃	Cl	Et	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	i-Pr	Me	CF ₃	Cl	i-Pr	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	i-Bu	Me	CF ₃	Cl	i-Bu	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	CH ₂ OH	Me	CF ₃	Cl	CH ₂ OH	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	Me	CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Me	Et				
CF ₃	Cl	Et	Et				
CF ₃	Cl	i-Pr	Et				
CF ₃	Cl	i-Bu	Et				
CF ₃	Cl	CH ₂ OH	Et				
CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	Et				

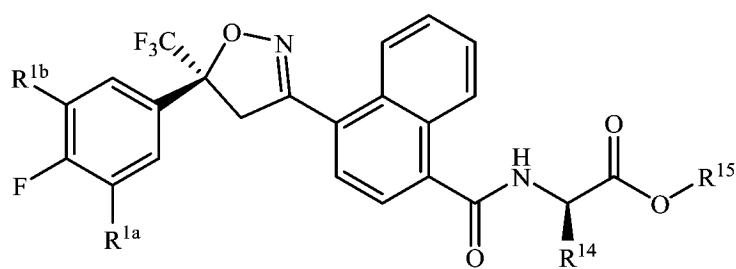
【0277】 表5-3



R ^{1a}	R ^{1b}	R ¹⁴	R ¹⁵	R ^{1a}	R ^{1b}	R ¹⁴	R ¹⁵
Cl	Cl	Me	H	CF ₃	H	Me	H
Cl	Cl	Et	H	CF ₃	H	Et	H
Cl	Cl	i-Pr	H	CF ₃	H	i-Pr	H
Cl	Cl	i-Bu	H	CF ₃	H	i-Bu	H
Cl	Cl	CH ₂ OH	H	CF ₃	H	CH ₂ OH	H

Cl	Cl	CH ₂ OMe	H		CF ₃	H	CH ₂ OMe	H
Cl	Cl	Me	Me		CF ₃	H	Me	Me
Cl	Cl	Et	Me		CF ₃	H	Et	Me
Cl	Cl	i-Pr	Me		CF ₃	H	i-Pr	Me
Cl	Cl	i-Bu	Me		CF ₃	H	i-Bu	Me
Cl	Cl	CH ₂ OH	Me		CF ₃	H	CH ₂ OH	Me
Cl	Cl	CH ₂ OMe	Me		CF ₃	H	CH ₂ OMe	Me
Cl	Cl	Me	Et		CF ₃	H	Me	Et
Cl	Cl	Et	Et		CF ₃	H	Et	Et
Cl	Cl	i-Pr	Et		CF ₃	H	i-Pr	Et
Cl	Cl	i-Bu	Et		CF ₃	H	i-Bu	Et
Cl	Cl	CH ₂ OH	Et		CF ₃	H	CH ₂ OH	Et
Cl	Cl	CH ₂ OMe	Et		CF ₃	H	CH ₂ OMe	Et
Cl	Cl	Me	i-Pr		CF ₃	H	Me	i-Pr
Cl	Cl	Et	i-Pr		CF ₃	H	Et	i-Pr
Cl	Cl	i-Pr	i-Pr		CF ₃	H	i-Pr	i-Pr
Cl	Cl	i-Bu	i-Pr		CF ₃	H	i-Bu	i-Pr
Cl	Cl	CH ₂ OH	i-Pr		CF ₃	H	CH ₂ OH	i-Pr
Cl	Cl	CH ₂ OMe	i-Pr		CF ₃	H	CH ₂ OMe	i-Pr
Cl	Cl	Me	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	Me	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	Et	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	Et	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	i-Pr	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	i-Pr	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	i-Bu	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	i-Bu	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	CH ₂ OH	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	CH ₂ OH	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	CH ₂ OMe	CH ₂ CF ₃		CF ₃	H	CH ₂ OMe	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Me	H		CF ₃	Cl	Me	i-Pr
CF ₃	Cl	Et	H		CF ₃	Cl	Et	i-Pr
CF ₃	Cl	i-Pr	H		CF ₃	Cl	i-Pr	i-Pr
CF ₃	Cl	i-Bu	H		CF ₃	Cl	i-Bu	i-Pr
CF ₃	Cl	CH ₂ OH	H		CF ₃	Cl	CH ₂ OH	i-Pr
CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	H		CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	i-Pr
CF ₃	Cl	Me	Me		CF ₃	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Et	Me		CF ₃	Cl	Et	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	i-Pr	Me		CF ₃	Cl	i-Pr	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	i-Bu	Me		CF ₃	Cl	i-Bu	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	CH ₂ OH	Me		CF ₃	Cl	CH ₂ OH	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	Me		CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Me	Et					
CF ₃	Cl	Et	Et					
CF ₃	Cl	i-Pr	Et					
CF ₃	Cl	i-Bu	Et					
CF ₃	Cl	CH ₂ OH	Et					
CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	Et					

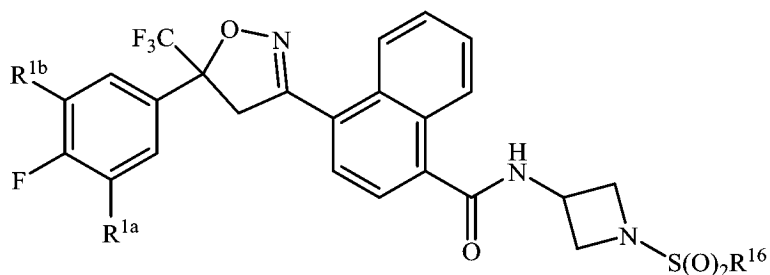
【0278】表5-4



R ^{1a}	R ^{1b}	R ¹⁴	R ¹⁵	R ^{1a}	R ^{1b}	R ¹⁴	R ¹⁵
Cl	Cl	Me	H	CF ₃	H	Me	H
Cl	Cl	Et	H	CF ₃	H	Et	H
Cl	Cl	i-Pr	H	CF ₃	H	i-Pr	H
Cl	Cl	i-Bu	H	CF ₃	H	i-Bu	H
Cl	Cl	CH ₂ OH	H	CF ₃	H	CH ₂ OH	H
Cl	Cl	CH ₂ OMe	H	CF ₃	H	CH ₂ OMe	H
Cl	Cl	Me	Me	CF ₃	H	Me	Me
Cl	Cl	Et	Me	CF ₃	H	Et	Me
Cl	Cl	i-Pr	Me	CF ₃	H	i-Pr	Me
Cl	Cl	i-Bu	Me	CF ₃	H	i-Bu	Me
Cl	Cl	CH ₂ OH	Me	CF ₃	H	CH ₂ OH	Me
Cl	Cl	CH ₂ OMe	Me	CF ₃	H	CH ₂ OMe	Me
Cl	Cl	Me	Et	CF ₃	H	Me	Et
Cl	Cl	Et	Et	CF ₃	H	Et	Et
Cl	Cl	i-Pr	Et	CF ₃	H	i-Pr	Et
Cl	Cl	i-Bu	Et	CF ₃	H	i-Bu	Et
Cl	Cl	CH ₂ OH	Et	CF ₃	H	CH ₂ OH	Et
Cl	Cl	CH ₂ OMe	Et	CF ₃	H	CH ₂ OMe	Et
Cl	Cl	Me	i-Pr	CF ₃	H	Me	i-Pr
Cl	Cl	Et	i-Pr	CF ₃	H	Et	i-Pr
Cl	Cl	i-Pr	i-Pr	CF ₃	H	i-Pr	i-Pr
Cl	Cl	i-Bu	i-Pr	CF ₃	H	i-Bu	i-Pr
Cl	Cl	CH ₂ OH	i-Pr	CF ₃	H	CH ₂ OH	i-Pr
Cl	Cl	CH ₂ OMe	i-Pr	CF ₃	H	CH ₂ OMe	i-Pr
Cl	Cl	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Me	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	Et	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Et	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	i-Pr	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	i-Pr	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	i-Bu	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	i-Bu	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	CH ₂ OH	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OH	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	CH ₂ OMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OMe	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Me	H	CF ₃	Cl	Me	i-Pr
CF ₃	Cl	Et	H	CF ₃	Cl	Et	i-Pr
CF ₃	Cl	i-Pr	H	CF ₃	Cl	i-Pr	i-Pr
CF ₃	Cl	i-Bu	H	CF ₃	Cl	i-Bu	i-Pr

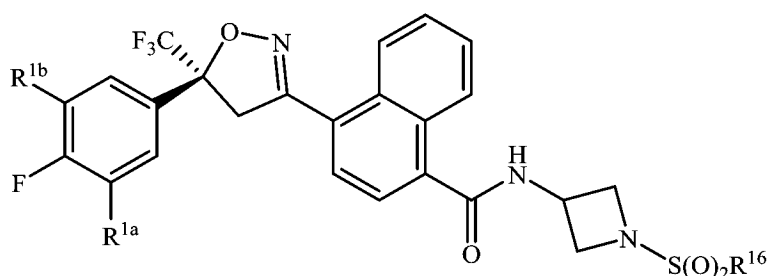
CF ₃	Cl	CH ₂ OH	H		CF ₃	Cl	CH ₂ OH	i-Pr
CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	H		CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	i-Pr
CF ₃	Cl	Me	Me		CF ₃	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Et	Me		CF ₃	Cl	Et	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	i-Pr	Me		CF ₃	Cl	i-Pr	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	i-Bu	Me		CF ₃	Cl	i-Bu	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	CH ₂ OH	Me		CF ₃	Cl	CH ₂ OH	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	Me		CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	CH ₂ CF ₃
CF ₃	Cl	Me	Et					
CF ₃	Cl	Et	Et					
CF ₃	Cl	i-Pr	Et					
CF ₃	Cl	i-Bu	Et					
CF ₃	Cl	CH ₂ OH	Et					
CF ₃	Cl	CH ₂ OMe	Et					

【0279】表6-1



R ^{1a}	R ^{1b}	R ¹⁶		R ^{1a}	R ^{1b}	R ¹⁶
Cl	Cl	Me		CF ₃	H	Me
Cl	Cl	F		CF ₃	H	F
Cl	Cl	NH ₂		CF ₃	H	NH ₂
CF ₃	Cl	Me				
CF ₃	Cl	F				
CF ₃	Cl	NH ₂				

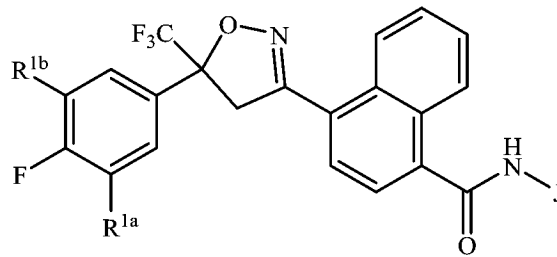
【0280】表6-2



R ^{1a}	R ^{1b}	R ¹⁶		R ^{1a}	R ^{1b}	R ¹⁶
Cl	Cl	Me		CF ₃	H	Me
Cl	Cl	F		CF ₃	H	F
Cl	Cl	NH ₂		CF ₃	H	NH ₂
CF ₃	Cl	Me				

CF ₃	Cl	F			
CF ₃	Cl	NH ₂			

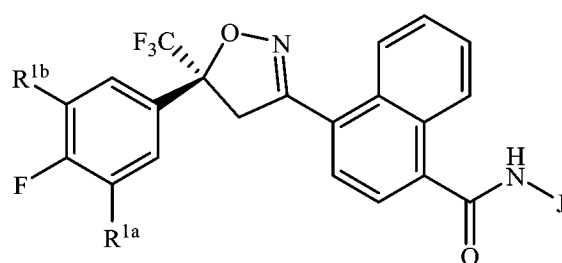
【0281】表7-1



R ^{1a}	R ^{1b}	J	R ^{1a}	R ^{1b}	J
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl	環丙基	CF ₃	H	環丙基
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
CF ₃	Cl		CF ₃	Cl	

CF ₃	Cl		CF ₃	Cl	
CF ₃	Cl		CF ₃	Cl	環丙基
CF ₃	Cl		CF ₃	Cl	
CF ₃	Cl		CF ₃	Cl	
CF ₃	Cl		CF ₃	Cl	

【0282】表7-2



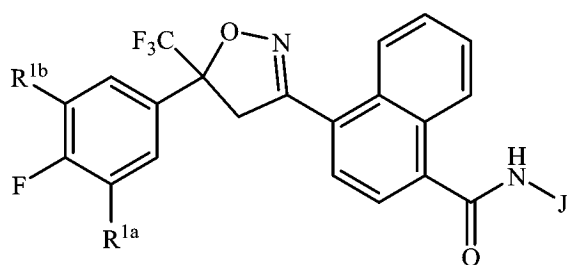
R ^{1a}	R ^{1b}	J	R ^{1a}	R ^{1b}	J
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl	環丙基	CF ₃	H	環丙基

Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
Cl	Cl		CF ₃	H	
CF ₃	Cl		CF ₃	Cl	
CF ₃	Cl		CF ₃	Cl	
CF ₃	Cl		CF ₃	Cl	環丙基
CF ₃	Cl		CF ₃	Cl	
CF ₃	Cl		CF ₃	Cl	
CF ₃	Cl		CF ₃	Cl	

【0283】 透過前述方案1-11以及合成實施例1-5中描述之方法以及變化方法製備的具體的式1之化合物顯示在以下之索引表中。可以使用以下縮寫：Cmpd表示化合物，t為二級，c為環，Me為甲基，Et為乙基，Ph為苯基。縮寫「Ex.」表示「實施例」，後面為數字，表示製備化合物的合成實施例。

【0284】 熔點數據(MP)報告為溫度範圍（例如，122-126）。質譜數據(MS)報告為單個數值（例如，542）。對於質譜數據(AP⁺(M+1))，報告的數值為透過對分子中加入H⁺(分子量為1)形成的母體分子離子(M)的分子量，得到M+1峰，透過使用大氣壓化學電離(AP⁺)的質譜法觀察。沒有報導與含有多個鹵素的化合物一起出現的交替分子離子峰（例如M+2或M+4）。

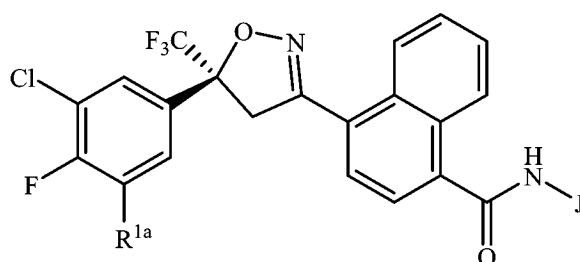
【0285】索引表A



化合物編號	R ^{1a}	R ^{1b}	J	熔點/ 質譜數據
1	Cl	Cl		542
2	CF ₃	Cl		575
3	Cl	Cl		556
4	Cl	Cl		570
5	Cl	Cl		78-82
6	Cl	Cl		122-126
7	Cl	Cl		147-151
43	CF ₃	H		106-110

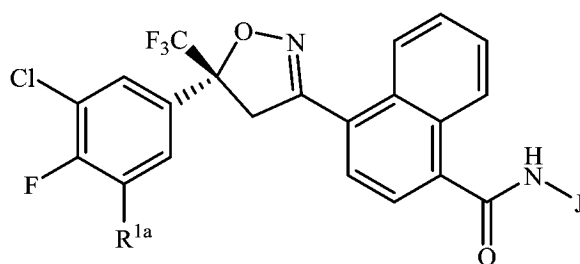
44	Cl	Cl		584
45	Cl	Cl		572
46	Cl	Cl		570
47	Cl	Cl		595
48	Cl	Cl		581

【0286】索引表A-1



化合物編號	R ^{1a}	J	質譜數據
8	Cl		542

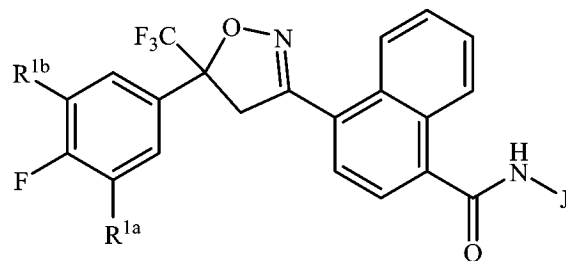
【0287】索引表A-2



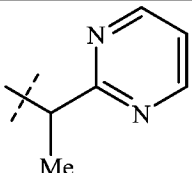
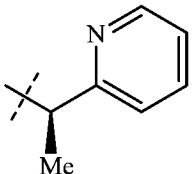
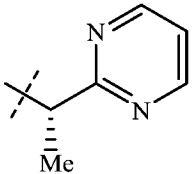
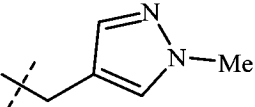
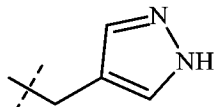
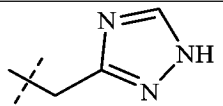
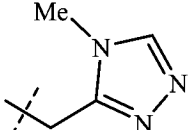
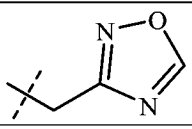
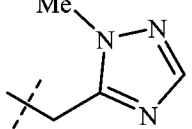
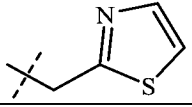
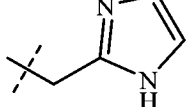
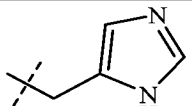
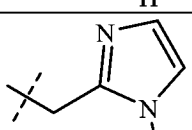
化合物編號	R ^{1a}	J	質譜數據
-------	-----------------	---	------

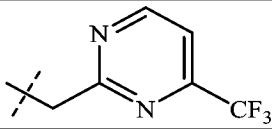
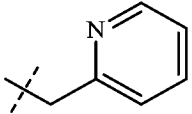
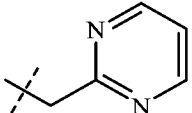
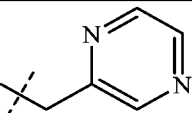
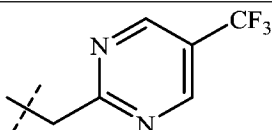
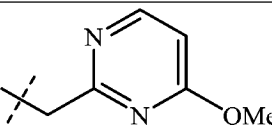
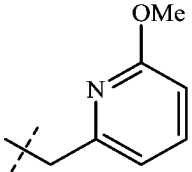
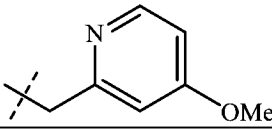
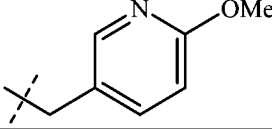
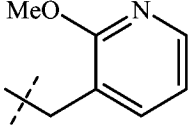
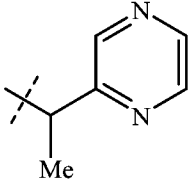
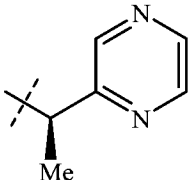
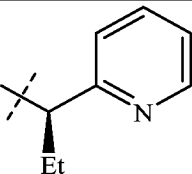
9	Cl		542
---	----	--	-----

【0288】索引表B

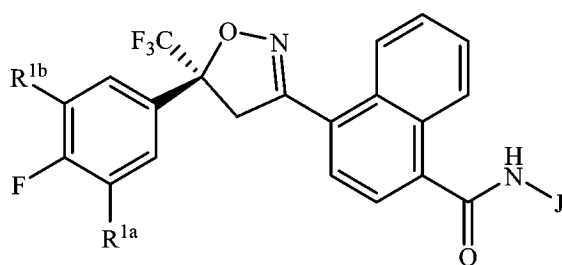


化合物編號	R ^{1a}	R ^{1b}	J	熔點/ 質譜數據
10	Cl	Cl		563
11	CF ₃	Cl		597
12	Cl	Cl		563
13	Cl	Cl		563
14	Cl	Cl		563
15	Cl	Cl		562
16	Cl	Cl		563
17	Cl	Cl		563
18	Cl	Cl		576

19	Cl	Cl		577
20	Cl	Cl		576
21	Cl	Cl		577
22	Cl	Cl		565
23	Cl	Cl		551
24	Cl	Cl		552
25	Cl	Cl		566
26	Cl	Cl		553
27	Cl	Cl		566
28	Cl	Cl		568
29	Cl	Cl		551
30	Cl	Cl		551
31	Cl	Cl		565

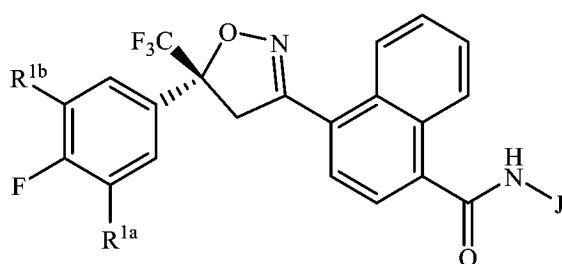
32	Cl	Cl		631
49	CF ₃	H		151-155
50	CF ₃	H		153-157
51	CF ₃	H		563
52	Cl	Cl		631
53	Cl	Cl		593
54	Cl	Cl		207-208
55	Cl	Cl		69-71
56	Cl	Cl		183-184
57	Cl	Cl		202-203
58	Cl	Cl		577
59	Cl	Cl		577
60	Cl	Cl		590

【0289】索引表B-1



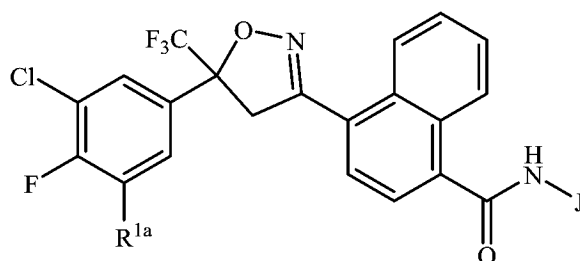
化合物編號	R ^{1a}	R ^{1b}	J	熔點/ 質譜數據
61	Cl	Cl		120-124
63	Cl	Cl		577

【0290】索引表B-2



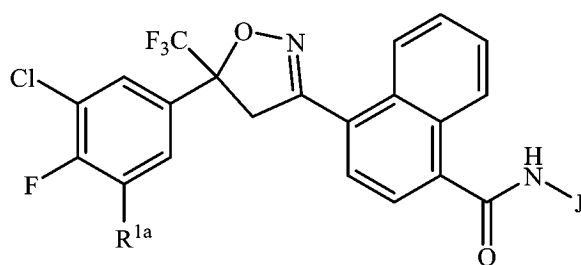
化合物編號	R ^{1a}	R ^{1b}	J	質譜數據
62	Cl	Cl		563

【0291】索引表C



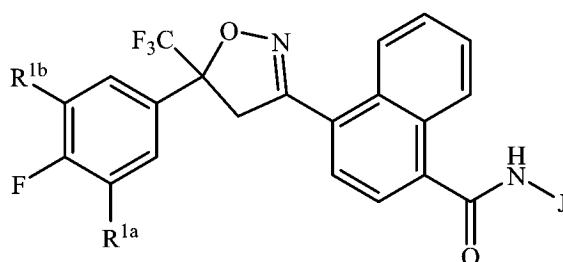
化合物編號	R ^{1a}	J	質譜數據
33	Cl		528

【0292】索引表D

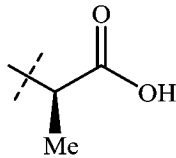
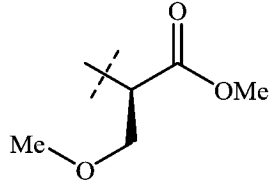
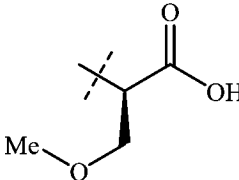
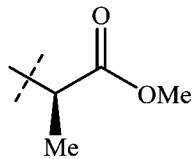
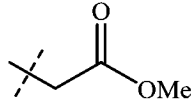


化合物編號	R ^{1a}	J	質譜數據
34	Cl		584
64	Cl		582

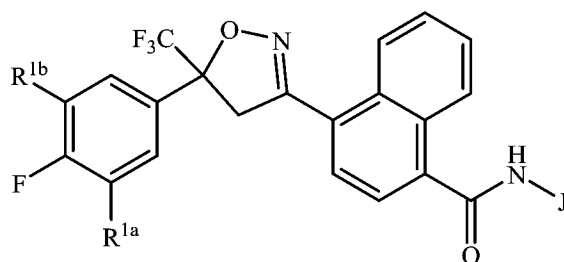
【0293】索引表E

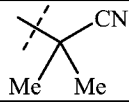
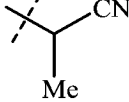
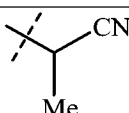
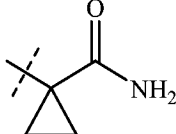


化合物編號	R ^{1a}	R ^{1b}	J	熔點/ 質譜數據
35	Cl	Cl		543
36	CF ₃	Cl		577
37	CF ₃	Cl		563
38	Cl	Cl		529
39	Cl	Cl		557

40	Cl	Cl		543
41	Cl	Cl		587
42	Cl	Cl		573
65	CF ₃	H		161-165
66	CF ₃	H		79-83

【0294】索引表F



化合物編號	R ^{1a}	R ^{1b}	J	熔點/ 質譜數據
67	CF ₃	H	環丙基	153-157
68	CF ₃	H		200-204
69	CF ₃	H		524
70	Cl	Cl	環丙基	511
71	Cl	Cl		524
72	Cl	Cl		256-260

/或懸乳劑)等,其可選擇地可以稠化成凝膠。一般類型的含水液體組合物為可溶性濃縮物、懸浮濃縮物、膠囊懸浮液、濃乳液、微乳液、水包油乳液、可流動濃縮物以及懸浮乳液。非水液體組合物的一般類型為可乳化濃縮物、可微乳化濃縮物、可分散濃縮物以及油分散體。

【0298】 固體組合物的一般類型為可水分散性(「可濕性」)或水溶性的粉塵、粉劑、顆粒劑、丸劑、小球劑、錠劑、片劑、填充膜(包括種子包衣)等。由成膜溶液或可流動懸浮液形成的膜以及塗層對種子處理特別有用。活性成分可以(微)封裝並進一步形成懸浮液或固體製劑;或者可以將活性成分的整個製劑包封(或「外塗」)。封裝可以控制或延遲活性成分的釋放。可乳化顆粒結合了可乳化濃縮物製劑以及乾燥顆粒製劑的優點。高強度組合物主要作為進一步配製的中間體。

【0299】 噴霧製劑在噴霧前通常在合適的介質中延伸。這樣的液體以及固體製劑配製成易於在噴霧介質(通常為水)中稀釋,但偶爾還有另一種合適的介質如芳香族烴或石蠟烴或植物油。噴灑量可為每公頃約一千升至幾千升,但更典型的是每公頃約十至幾百升。可噴霧製劑可與水或其他合適的培養基罐混,以透過空中或地面施用葉面處理,或施用於植物生長培養基。液體以及乾燥製劑可以直接計量加入滴灌系統或在種植過程中計量加入犁溝。可以在種植前將液體以及固體製劑施用到作物的種子以及其他期望的植物上作為種子處理,以透過全身吸收保護發育根以及其他地下植物部分及/或葉。

【0300】 製劑通常含有有效量的活性成分、稀釋劑以及介面活性劑,其含量在以下大致範圍內,合計達100重量%。

	重量百分比		
	活性成分	稀釋劑	介面活性劑
水分散性與水溶性顆粒劑、片劑及粉劑	0.001-90	0-99.999	0-15
油分散液、懸浮液、乳液、溶液(包括可乳化濃縮物)	1-50	40-99	0-50
粉塵	1-25	70-99	0-5
顆粒劑與丸劑	0.001-99	5-99.999	0-15
高強度組合物	90-99	0-10	0-2

【0301】 固體稀釋劑包括，例如，黏土如膨潤土、蒙脫石、綠坡縷石以及高嶺土、石膏、纖維素、二氧化鈦、氧化鋅、澱粉、糊精、糖（例如乳糖、蔗糖）、二氧化矽、滑石、雲母、矽藻土、尿素、碳酸鈣、碳酸鈉以及碳酸氫鈉以及硫酸鈉。典型的固體稀釋劑描述於Watkins等人，Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books出版社，Caldwell，紐澤西州。

【0302】 液體稀釋劑包括，例如，水、N,N-二甲基烷基醯胺（例如，N,N-二甲基甲醯胺）、檸檬烯、二甲基亞砷、N-烷基吡咯烷酮（例如，N-甲基吡咯烷酮）、磷酸烷基酯（例如，磷酸三乙酯）、乙二醇、三乙烯乙二醇、丙二醇、二丙二醇、聚丙二醇、碳酸丙烯酯、碳酸丁烯酯、鏈烷烴（例如，白礦物油、正鏈烷烴、異鏈烷烴）、烷基苯、烷基萘、甘油、三乙酸甘油酯、山梨糖醇、芳香族碳氫化合物、脫芳脂肪、烷基苯、烷基萘、酮類，如環己酮、2-庚酮、異佛爾酮以及4-羥基-4-甲基-2-戊酮、乙酸酯，如乙酸異戊酯、乙酸己酯、乙酸庚酯、乙酸辛酯、乙酸壬酯、乙酸十三酯，以及乙酸異冰片酯等酯類如烷基化乳酸酯、二元酯、苯甲酸烷基以及芳基酯、 γ -丁內酯，以及可為直鏈、支鏈、飽和或不飽和的醇，例如甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、正己醇、2-乙基己醇、正辛醇、癸醇、異癸醇、異十八烷醇、鯨蠟醇、月桂醇、十三烷醇、油醇、環己

醇、四氫糠醇、雙丙酮醇、甲酚以及苯甲醇。液體稀釋劑還包括飽和以及不飽和脂肪酸的甘油酯(典型地， C_6-C_{22})，例如植物種子以及果實油（例如，橄欖油、蓖麻油、亞麻籽油、芝麻油、玉米油(**maize**)、花生油、向日葵油、葡萄籽油、紅花油、棉籽油、大豆油、菜籽油、椰子油以及棕櫚油等）、動物源脂肪（例如，牛脂、豬油、魚肝油、魚油）及其混合物。液體稀釋劑還包括烷基化脂肪酸（例如，甲基化、乙基化、丁基化），其中脂肪酸可透過來自植物以及動物來源的甘油酯的水解而獲得，且可透過蒸餾純化。典型的液體稀釋劑描述於 Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience出版社，紐約，1950。

【0303】 本發明的固體以及液體組合物通常包括一種或多種介面活性劑。當添加到液體中時，介面活性劑（也稱為「表面活性劑」）通常會改變液體的表面張力，通常會降低表面張力。取決於介面活性劑分子中親水性以及親脂性基團的性質，介面活性劑可作為潤濕劑、分散劑、乳化劑或消泡劑。

【0304】 介面活性劑可分類為非離子、陰離子或陽離子。可用於本發明組合物的非離子介面活性劑包括，但不限於：醇烷氧基化物，例如基於天然以及合成醇（其可為支鏈或直鏈）並由醇以及環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物製備；胺乙氧基化物、鏈烷醇醯胺以及乙氧基化鏈烷醇醯胺；烷氧基化甘油三酯，如乙氧基化大豆油、蓖麻油以及菜籽油；烷基酚烷氧基化物，如辛基酚乙氧基化物、壬基酚乙氧基化物、二壬基酚乙氧基化物以及十二烷基酚乙氧基化物（由酚以及環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物製備）；由環氧乙烷或環氧丙烷製備的嵌段聚合物以及反應性嵌段聚合物，其中末端嵌段由環氧丙烷製備；乙氧基化脂肪酸；乙氧基化脂肪酯以及油；乙氧基化甲酯；乙氧基化三苯乙炔基苯酚（包括由環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物製備的那些）；脂

肪酸酯、甘油酯、羊毛脂基衍生物、聚乙氧基化酯，如聚乙氧基化脫水山梨糖醇脂肪酸酯、聚乙氧基化山梨糖醇脂肪酸酯以及聚乙氧基化甘油脂肪酸酯；其他脫水山梨糖醇衍生物，例如，脫水山梨糖醇酯；聚合性介面活性劑，如無規共聚物、嵌段共聚物、醇酸樹脂（聚乙二醇）樹脂、接枝或梳形聚合物以及星形聚合物；聚乙二醇(PEGs)；聚乙二醇脂肪酸酯；矽基介面活性劑；以及糖衍生物，如蔗糖酯、烷基聚糖苷以及烷基多糖。

【0305】 有用的陰離子介面活性劑包括，但不限於：烷基芳基磺酸及其鹽類；羧化醇或烷基酚乙氧基化物；二苯基磺酸酯衍生物；木質素以及木質素衍生物如木質素磺酸鹽類；馬來酸或琥珀酸或其酸酐；烯烴磺酸鹽類；磷酸酯，例如，醇烷氧基化物的磷酸酯，烷基酚烷氧基化物的磷酸酯以及苯乙烯基苯酚乙氧基化物的磷酸酯；蛋白質基介面活性劑；肌胺酸衍生物；苯乙烯基苯酚醚硫酸鹽類；油以及脂肪酸的硫酸鹽類以及磺酸鹽類；乙氧基化烷基酚的硫酸鹽類以及磺酸鹽類；醇的硫酸鹽類；乙氧基化醇的硫酸鹽類；胺以及醯胺的磺酸鹽類，例如N,N-烷基牛磺酸鹽類；苯枯、烯、甲苯、二甲苯以及十二烷基以及十三烷基苯的磺酸鹽類；縮合萘磺酸鹽類；萘以及烷基萘的磺酸鹽類；分餾石油磺酸鹽類；磺基琥珀；以及磺基琥珀酸鹽類及其衍生物如磺基琥珀酸二烷基酯鹽類。

【0306】 有用的陽離子介面活性劑包括，但不限於：醯胺以及乙氧基化醯胺；胺如N-烷基丙烷二胺、三丙烯三胺以及二丙烯四胺，以及乙氧基化胺、乙氧基化二胺以及丙氧基化胺(由胺以及環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物製備)；胺鹽類如乙酸胺以及二胺鹽類；季銨鹽類如季鹽類、乙氧基化季鹽類以及雙季鹽類；以及氧化胺如烷基二甲基胺氧化物以及雙-(2-羥基乙基)-烷基胺氧化物。

【0307】本發明組合物還可以使用非離子以及陰離子介面活性劑的混合物或非離子以及陽離子介面活性劑的混合物。非離子、陰離子以及陽離子介面活性劑及其推薦用途公開於各種公開的參考文獻中，包括*McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*，年度美國與國際版由McCutcheon's Division出版，The Manufacturing Confectioner出版公司；Sisely與Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical出版公司，紐約，1964；以及A. S. Davidson與B. Milwidsky, *Synthetic Detergents, Seventh Edition*, John Wiley and Sons出版社，紐約，1987。

【0308】本發明的組合物還可含有本領域技術人員已知作為製劑助劑（其中一些可被認為也作為固體稀釋劑、液體稀釋劑或介面活性劑的作用）的製劑助劑以及添加劑。這種製劑助劑以及添加劑可以控制：pH（緩衝劑）、加工期間的起泡（消泡劑如聚有機矽氧烷）、活性成分（懸浮劑）的沉降、黏度（觸變增稠劑）、容器內微生物生長（抗微生物劑）、產品冷凍（抗凍劑）、顏色（染料/顏料分散體）、沖洗（成膜劑或貼紙）、蒸發（蒸發阻滯劑），以及其他配方屬性。成膜劑包括，例如，聚乙酸乙烯酯、聚乙酸乙烯酯共聚物、聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯酯共聚物、聚乙烯醇、聚乙烯醇共聚物以及蠟。製劑助劑以及添加劑的實例包括由*McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*，年度國際及北美版由McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner出版公司出版；以及PCT公開號WO 03/024222所列的那些。

【0309】式1之化合物以及任何其它活性成分通常透過將活性成分溶解在溶劑中或透過在液體或乾燥稀釋劑中研磨而摻入本發明組合物中。包括可乳化濃縮物在內的溶液可以透過簡單地混合這些成分來製備。如果打算作為可乳化濃縮物的液體組合物的溶劑是不溶於水的，通常加入乳化劑以在以水稀釋時乳

化含有活性物質的溶劑。可以使用介質研磨機濕磨粒徑高達2,000 μm 的活性成分漿料，以獲得平均直徑小於3 μm 的顆粒。可以將含水漿料製成成品懸浮濃縮物(參見，例如，美國專利3,060,084)或透過噴霧乾燥進一步處理以形成水分散性顆粒。乾配方通常需要乾磨工藝，其產生2至10 μm 範圍內的平均粒徑。粉塵以及粉末可以透過摻合以及通常研磨來製備(例如，以錘磨機或流體能粉碎機)。顆粒劑以及丸劑可透過將活性物質噴到預製的顆粒載體上或透過團聚技術來製備。參見Browning, “Agglomeration”, *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147-48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill出版社，紐約，1963, pp 8-57及後續，以及WO 91/13546。丸粒可以按照美國專利號US 4,172,714中所述製備。水分散性以及水溶性顆粒劑可以按照美國專利號US 4,144,050、US 3,920,442以及德國專利號DE 3,246,493中的教導製備。片劑可以按照美國專利號US 5,180,587、US 5,232,701以及US 5,208,030中的教導製備。可按照英國專利號GB 2,095,558以及美國專利號US 3,299,566中的教導製備薄膜。

【0310】關於配方技術的進一步資訊，參見T. S. Woods, “The Formulator’s Toolbox – Product Forms for Modern Agriculture” in *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food–Environment Challenge*, T. Brooks與T. R. Roberts編輯，第9屆國際農藥化學大會的進展，英國皇家化學學會，劍橋，1999年，第120-133頁。也參見美國專利號US 3,235,361，第6欄第16行至第7欄第19行以及實施例10-41；US 3,309,192，第5欄第43行至第7欄第62行以及實施例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138-140、162-164、166、167以及169-182；美國專利號US 2,891,855，第3欄第66行至第5欄第17行以及實施例1-4；Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons公司，紐約，1961, pp 81-96；Hance等人，*Weed Control* 第 81 頁，共 128 頁(發明說明書)

Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific出版社，牛津，1989；以及Developments in formulation technology, PJB出版社，Richmond，英國，2000。

【0311】 在以下實施例中，所有製劑均以常規方式製備。化合物編號參考索引表A-G中的化合物。無需進一步詳述，相信本領域技術人員使用前述說明可以最充分地利用本發明。因此，以下實施例僅被解釋為說明性的，而不以任何方式限制本案。除非另有說明，否則百分比按重量計。

【0312】 實施例A

高濃度濃縮物	
化合物 1	98.5%
二氧化矽氣凝膠	0.5%
合成無定形細矽石	1.0%

【0313】 實施例B

可濕性粉劑	
化合物 3	65.0%
十二烷基酚聚乙二醇醚	2.0%
木素磺酸鈉	4.0%
矽鋁酸鈉	6.0%
蒙脫石(煨燒)	23.0%

【0314】 實施例C

顆粒	
化合物 8	10.0%
微粒(低揮發物，0.71/0.30 mm；美國 25-50 號篩)	90.0%

【0315】 實施例D

擠壓丸	
化合物 10	25.0%
無水硫酸鈉	10.0%
粗木素磺酸鈣	5.0%
烷基萘磺酸鈉	1.0%
鈣/鎂膨潤土	59.0%

【0316】 實施例E

可乳化濃縮物	
化合物 11	10.0%
聚氧乙烯山梨糖醇己酸酯	20.0%
C ₆ -C ₁₀ 脂肪酸甲酯	70.0%

【0317】 實施例F

微乳	
化合物 19	5.0%
聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯酯共聚物	30.0%
烷基多糖苷	30.0%
甘油單油酸酯	15.0%
水	20.0%

【0318】 實施例G

種子處理劑	
化合物 20	20.00%
聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯酯共聚物	5.00%
褐煤酸蠟	5.00%
木質素磺酸鈣	1.00%
聚氧乙烯/聚氧丙烯嵌段共聚物	1.00%
硬脂醇(POE 20)	2.00%
聚有機矽氧烷	0.20%
著色劑紅染料	0.05%
水	65.75%

【0319】 實施例H

肥料棒	
化合物 33	2.5%
吡咯烷酮-苯乙烯共聚物	4.8%
三苯乙烯基苯基 16-乙氧基化物	2.3%
滑石	0.8%
玉米澱粉	5.0%
緩釋肥料	36.0%
高嶺土	38.0%
水	10.6%

【0320】 實施例I

懸浮濃縮物	
化合物 34	35%
丁基聚氧乙烯/聚丙烯嵌段共聚物	4.0%

硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
苯乙烯丙烯酸聚合物	1.0%
黃原膠	0.1%
丙二醇	5.0%
矽基消泡劑	0.1%
1,2-苯並異噻唑-3-酮	0.1%
水	53.7%

【0321】 實施例J

水中的乳液

化合物 39	10.0%
丁基聚氧乙烯/聚丙烯嵌段共聚物	4.0%
硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
苯乙烯丙烯酸聚合物	1.0%
黃原膠	0.1%
丙二醇	5.0%
矽基消泡劑	0.1%
1,2-苯並異噻唑-3-酮	0.1%
芳香族石油基烴	20.0
水	58.7%

【0322】 實施例K

油分散物

化合物 50	25%
聚氧乙烯山梨糖醇六油酸酯	15%
有機改性的膨潤土	2.5%
脂肪酸甲酯	57.5%

【0323】 實施例L

懸乳劑

化合物 61	10.0%
益達胺(imidacloprid)	5.0%
丁基聚氧乙烯/聚丙烯嵌段共聚物	4.0%
硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
苯乙烯丙烯酸聚合物	1.0%
黃原膠	0.1%
丙二醇	5.0%
矽基消泡劑	0.1%
1,2-苯並異噻唑-3-酮	0.1%
芳香族石油基烴	20.0%

水	53.7%
【0324】 實施例M	
懸浮濃縮液	
化合物 67	35%
丁基聚氧乙烯/聚丙烯嵌段共聚物	4.0%
硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
苯丙烯腈聚合物	1.0%
黃原膠	0.1%
丙二醇	5.0%
矽基消泡劑	0.1%
1,2-苯並異噻唑-3-酮	0.1%
水	53.7%
【0325】 實施例N	
水中的乳液	
化合物 69	10.0%
丁基聚氧乙烯/聚丙烯嵌段共聚物	4.0%
硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
苯丙烯腈聚合物	1.0%
黃原膠	0.1%
丙二醇	5.0%
矽基消泡劑	0.1%
1,2-苯並異噻唑-3-酮	0.1%
芳香族石油基烴	20.0
水	58.7%
【0326】 實施例O	
油分散液	
化合物 70	25%
聚氧乙烯山梨糖醇六油酸酯	15%
有機改質膨潤土	2.5%
脂肪酸甲酯	57.5%
【0327】 實施例P	
懸乳劑	
化合物 71	10.0%
益達胺(imidacloprid)	5.0%
丁基聚氧乙烯/聚丙烯嵌段共聚物	4.0%
硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%

苯丙烯腈聚合物	1.0%
黃原膠	0.1%
丙二醇	5.0%
矽基消泡劑	0.1%
1,2-苯並異噻唑-3-酮	0.1%
芳香族石油基烴	20.0%
水	53.7%

【0328】 本發明之化合物對廣泛範圍的無脊椎害蟲具有活性。這些害蟲包括棲息在各種環境中的無脊椎動物，例如植物葉子、根、土壤、收穫的作物或其他食物，或建築結構。這些害蟲包括，例如，無脊椎動物以葉子為食（包括葉子、莖、花，以及果實）、種子、木材或紡織纖維，並從而導致傷害或損壞，例如，種植或儲存農作物、森林、溫室作物、觀賞植物、苗圃作物、儲存的食品或纖維產品，或房屋或其他結構或其內容。本領域技術人員將理解，並非所有化合物對所有害蟲的所有生長階段都同樣有效。

【0329】 因此，這些本發明之化合物以及組合物在農業上用於保護田間作物免受植食性無脊椎害蟲的侵害，並且非農業上用於保護其它園藝作物與植物免受植食性無脊椎害蟲的侵害。該實用程序包括保護作物以及其他植物（即農學與非農學），其含有透過遺傳工程（即，轉基因）引入的遺傳物質或透過誘變進行修飾以提供有利的性狀。這些性狀的實例包括對除草劑的耐受性、對植食性害蟲（例如，昆蟲、蠕蟲、蚜蟲、蜘蛛、線蟲、蝸牛、植物致病真菌、細菌，以及病毒）的抗性，改善植物生長，對不利生長條件的耐受性增加，如高溫或低溫，土壤濕度低或高，鹽度高，開花或結果增加，收穫率更高，更快速的成熟，收穫產品的更高質量及/或營養價值，或改善收穫產品的儲存或加工性能。可以修飾轉基因植物以表現多種性狀。透過基因工程或誘變提供的含有性狀的植物的實例包括，表現殺蟲蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)毒素的玉米、棉花、大豆，以及馬

鈴薯品種，例如YIELD GARD®、KNOCKOUT®、STARLINK®、BOLLGARD®、NuCOTN®，以及NEWLEAF®、INVICTA RR² PRO™，以及耐除草劑的玉米、棉花、大豆，以及油菜等品種如 ROUNDUP READY®、LIBERTY LINK®、IMI®、STS®以及CLEARFIELD®，以及表現N-乙醯轉移酶(N-acetyltransferase，GAT)以提供對草甘膦除草劑之抗性的作物，或含有HRA基因的作物對抑制乙醯乳酸合成酶（acetolactate synthase，ALS）的除草劑具有抗性。本發明之化合物以及組合物可透過基因工程引入或通過誘變修飾的性狀表現出增強的作用，因此，增強了性狀的表型表現或有效性或增加了本發明之化合物以及組合物的無脊椎害蟲防治效力。特別是，本發明之化合物以及組合物可以表現出對無脊椎害蟲有毒的蛋白質或其它天然產物的表型表現的增強作用，以提供對這些害蟲的大於添加效果之防治。

【0330】 本發明之組合物還可任選地包含植物營養素，例如，包含至少一種選自氮、磷、鉀、硫、鈣、鎂、鐵、銅、硼、錳、鋅，以及鉬的植物營養素的肥料組合物。值得注意的是，包含至少一種肥料組合物之組合物，該肥料組合物包含至少一種選自氮、磷、鉀、硫、鈣，以及鎂的植物營養素。進一步包含至少一種植物營養素的發明組合物可為液體或固體形式。值得注意的是，顆粒、小棒或片劑形式的固體製劑。包含肥料組合物的固體製劑可透過將本發明之化合物或組合物與肥料組合物一起與配製成分混合，然後透過例如造粒或擠出的方法製備製劑而製備。或者，固體製劑可透過將本發明之化合物或組合物的溶液或懸浮液在揮發性溶劑中噴霧到預先製備的肥料組合物上，製備成尺寸穩定的混合物，例如顆粒、小棒或片劑，然後蒸發溶劑。

【0331】 非農學用途係指除農作物田間以外的區域的無脊椎害蟲防治。本發明之化合物以及組合物的非農學用途包括，控制儲存的穀物、豆類以及其他食品，以及紡織品如衣服及地毯中的無脊椎害蟲。本發明之化合物以及組合物的非農業用途還包括在觀賞植物、森林、院子裡、沿路邊，以及鐵路路權，以及草坪，如草坪、高爾夫球場，以及牧場中的無脊椎害蟲防治。本發明之化合物以及組合物的非農業用途還包括在人類及/或伴侶、農場、牧場、動物園或其它動物可能佔據的房屋及其他建築物中的無脊椎害蟲防治。本發明之化合物以及組合物的非農學用途還包括控制害蟲如白蟻，這些害蟲可損害建築物中使用的木材或其他結構材料。

【0332】 農業或非農業的無脊椎害蟲之實例包括鱗翅目(family Noctuidae)的卵、幼蟲及成蟲，如夜蛾科(Noctuidae)中的行軍蟲、切根蟲、夜蛾，以及黏蟲（例如，粉紅螟蟲(*Sesamia inferens* Walker)、玉米螟蟲(*Sesamia nonagrioides* Lefebvre)、南方行軍蟲(*Spodoptera eridania* Cramer)、秋行軍蟲(*Spodoptera frugiperda* J. E. Smith)、甜菜行軍蟲(*Spodoptera exigua* Hübner)、棉葉蟲(*Spodoptera littoralis* Boisduval)、黃條行軍蟲(*Spodoptera ornithogalli* Guenée)、黑切根蟲(*Agrotis ipsilon* Hufnagel)、佛州藜豆毛毛蟲(*Anticarsia gemmatalis* Hübner)、綠果蠅(*Lithophane antennata* Walker)、甘藍行軍蟲(*Barathra brassicae* Linnaeus)、黃豆夜蛾(*Pseudoplusia includens* Walker)、甘藍夜蛾(*Trichoplusia ni* Hübner)、煙青蟲(*Heliothis virescens* Fabricius))；來自螟蛾科(Pyralidae)的蛀蟲、箱蛾幼蟲、結網毛蟲、錐蟲、捲葉菜蟲，以及骨化蟲（例如，歐洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis* Hübner)、臍橙螟蛾 (*Amyelois transitella* Walker)、玉米根草螟(*Crambus caliginosellus* Clemens)、草地螟 (螟蛾科：草螟亞科(Crambinae))例如草皮蟲

(*Herpetogramma licarsialis* Walker)、甘蔗莖螟(*Chilo infuscatellus* Snellen)、番茄小螟(*Neoleucinodes elegantalis* Guenée)、綠葉捲葉蟲(*Cnaphalocrocis medinalis*)、葡萄捲葉蟲(*Desmia funeralis* Hübner)、甜瓜蟲(*Diaphania nitidalis* Stoll)、甘藍菜中心蟻蝨蟲(*Helluala hydralis* Guenée)、黃莖螟(*Scirpophaga incertulas* Walker)、早梢螟(*Scirpophaga infuscatellus* Snellen)、白莖螟(*Scirpophaga innotata* Walker)、頂莖螟蟲(*Scirpophaga nivella* Fabricius)、黑頭螟(*Chilo polychrysus* Meyrick)、條紋水稻螟蟲(*Chilo suppressalis* Walker)、甘藍菜叢毛蟲(*Crocidolomia binotalis* English))；在捲葉蛾科(*Tortricidae*)的捲葉蟲、青蟲、種子蟲，以及夜蛾(例如，蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella* Linnaeus)、葡萄漿果蛾(*Endopiza viteana* Clemens)、東方水果蛾(*Grapholita molesta* Busck)、柑橘假蘋果蠹蛾(*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick)、柑橘蛀蟲(*Ecdytolopha aurantiana* Lima)、紅斜紋卷葉蟲(*Argyrotaenia velutinana* Walker)、斜紋卷葉蟲(*Choristoneura rosaceana* Harris)、淺棕色蘋果蛾(*Epiphyas postvittana* Walker)、歐洲葡萄漿果蛾(*Eupoecilia ambiguella* Hübner)、蘋果芽蛾(*Pandemis pyrusana* Kearfott)、雜食性捲葉蟲(*Platynota stultana* Walsingham)、葡萄褐捲葉蟲(*Pandemis cerasana* Hübner)、蘋果褐捲葉蟲(*Pandemis heparana* Denis & Schiffermüller))；以及許多其他經濟上重要的鱗翅目(*lepidoptera*)昆蟲(例如，小菜蛾(*Plutella xylostella* Linnaeus)、粉紅鈴蟲(*Pectinophora gossypiella* Saunders)、吉普賽蛾(*Lymantria dispar* Linnaeus)、桃果螟(*Carposina niponensis* Walsingham)、桃枝螟(*Anarsia lineatella* Zeller)、馬鈴薯蠹蛾(*Phthorimaea operculella* Zeller)、斑點穗狀葉蟬(*Lithocolletis blancardella* Fabricius)、亞洲蘋果葉蟬(*Lithocolletis ringoniella* Matsumura)、水稻捲葉蟲(*Lerodea eufala* Edwards)、蘋果潛葉蛾(*Leucoptera scitella* Zeller))；蜚蠊目

(Blattodea)的蟲卵、幼蟲、成蟲，包括來自姬蜚蠊科(Blattellidae)與蜚蠊科(Blattidae)的蟑螂（例如，東方蟑螂(*Blatta orientalis* Linnaeus)、亞洲蟑螂(*Blattella asahinai* Mizukubo)、德國蟑螂(*Blattella germanica* Linnaeus)、棕帶蟑螂(*Supella longipalpa* Fabricius)、美洲蟑螂(*Periplaneta americana* Linnaeus)、棕色蟑螂(*Periplaneta brunnea* Burmeister)、馬德拉蟑螂(*Leucophaea maderae* Fabricius)、煙熏棕色蟑螂(*Periplaneta fuliginosa* Service)、澳洲蟑螂(*Periplaneta australasiae* Fabr.)、龍蝦蟑螂(*Nauphoeta cinerea* Olivier)，以及光滑蟑螂 (*Symploce pallens* Stephens))；鞘翅目(Coleoptera)昆蟲的蟲卵、採食葉片、果實、根部、種子以及囊泡的幼蟲以及成蟲，包括來自長角象鼻蟲科(Anthribidae)、豆象科(Bruchidae)，以及象鼻蟲科(Curculionidae)的象鼻蟲（例如，棉子象鼻蟲(*Anthonomus grandis* Boheman)、水稻象鼻蟲(*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel)、糧倉象鼻蟲(*Sitophilus granarius* Linnaeus)、稻米象鼻蟲(*Sitophilus oryzae* Linnaeus))、一年生藍草象鼻蟲(*Listronotus maculicollis* Dietz)、藍草象鼻蟲(*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal)、狩獵象鼻蟲 (*Sphenophorus venatus vestitus*)、丹佛象鼻蟲(*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus))；金花蟲科(Chrysomelidae)的跳蚤甲蟲、黃瓜甲蟲、根蟲、葉甲蟲、馬鈴薯甲蟲，以及斑潛蠅（例如，科羅拉多馬鈴薯甲蟲(*Leptinotarsa decemlineata* Say)、西方玉米根蟲(*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte))；來自金龜子科(Scarabaeidae)的金龜子以及其他甲蟲（例如，日本甲蟲(*Popillia japonica* Newman)、東方甲蟲 (*Anomala orientalis* Waterhouse, *Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud)、北方蒙面金龜子(*Cyclocephala borealis* Arrow)、南方蒙面金龜子 (*Cyclocephala immaculata* Olivier或*C. lurida* Bland)、蜣螂以及白蟻螞蟥(*Aphodius* spp.)、黑色草坪金龜蟲(*Ataenius spretulus* Haldeman)、綠色六月甲蟲

(*Cotinis nitida* Linnaeus)、亞洲花園甲蟲(*Maladera castanea* Arrow)、五月/六月甲蟲(*Phyllophaga* spp.)，以及歐洲金龜子(*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky))；來自鱈節蟲科(Dermestidae)的地毯甲蟲；來自叩頭蟲科(Elateridae)的金針蟲；來自小蠹蟲科(Scolytidae)的樹皮甲蟲，以及來自擬步行蟲科(Tenebrionidae)的麵粉甲蟲。

【0333】此外，農業或非農業的害蟲包括：革翅目(Dermaptera)的卵、成蟲，以及幼蟲，包括來自蠨蠊科(Forficulidae)的蠨蠊（例如，歐洲蠨蠊(*Forficula auricularia* Linnaeus)、黑色蠨蠊(*Chelisoche morio* Fabricius))；半翅目(Hemiptera)與同翅亞目(Homoptera)的卵、未成熟、成蟲、稚蟲例如，來自盲蝽科(Miridae)的盲蝽、來自蟬科(Cicadidae)的蟬、來自葉蟬科(Cicadellidae)的葉蟬（例如，棉花小綠葉蟬*Empoasca* spp.）、來自臭蟲科(Cimicidae)的床蟲（例如，溫帶床蟲*Cimex lectularius* Linnaeus）、來自蠟蟬總科(Fulgoroidea)與稻蟲科(Delphacidae)的褐飛蟲、來自角蟬科(Membracidae)的角蟬、來自木蝨科(Psyllidae)的木蝨、來自粉蝨科(Aleyrodidae)的粉蝨、來自常蚜科(Aphididae)的蚜蟲、來自根瘤蚜科(Phylloxera)的根瘤蚜、來自粉介殼蟲科(Pseudococcidae)的粉介殼蟲、來自介殼蟲科(Coccidae)、盾介殼蟲科(Diaspididae)，以及碩介殼蟲科(Margarodidae)的介殼蟲、來自網蝽科(Tingidae)的軍配蟲、來自蝽科(Pentatomidae)的臭蟲、來自長蝽科(Lygaeidae)的麥虱（例如，如，毛長蝽(*Blissus leucopterus hirtus* Montandon)以及南方長蝽(*Blissus insularis* Barber))以及其他昆蟲、來自沫蟬科(Cercopidae)的沫蟬、來自緣蝽科(Coreidae)的南瓜蟲，以及來自紅蝽科(Pyrrhocoridae)的紅蝽與污棉蝽。

【0334】 農業或非農業的害蟲還包括：蟎蜱目(Acari) (蟎蟲)的卵、幼蟲、稚蟲以及成蟲，例如，葉蟎科(Tetranychidae)的蜘蛛蟎及紅蟎（例如，歐洲紅蟎 (*Panonychus ulmi* Koch)、雙斑點蜘蛛蟎(*Tetranychus urticae* Koch)、麥氏葉蟎 (*Tetranychus mcDanieli* McGregor)）；偽葉蟎科(Tenuipalpidae)的葉蟎（例如，柑橘扁蟎(*Brevipalpus lewisi* McGregor)）；節蟎科(Eriophyidae)的鏽蟎與芽蟎，以及其他在表皮蟎科(Epidermoptidae)的食葉蟎、塵蟎、蠕形蟎科(Demodicidae)的葉蟎、在食甜蟎科(Glycyphagidae)的谷蟎；在硬蟎科(Ixodidae)的蟎，通常稱為硬蟎（例如，鹿蟎(*Ixodes scapularis* Say)、澳洲癱瘓蟎(*Ixodes holocyclus* Neumann)、美國狗蟎(*Dermacentor variabilis* Say)、孤星蟎(*Amblyomma americanum* Linnaeus)）以及在軟蟎科(Argasidae)的蟎，通常稱為軟蟎（例如，復發性發熱蟎(*Ornithodoros turicata*)、常見的家禽蟎 (*Argas radiatus*)）；在怪蟎科(Psoroptidae)、蒲蟎科(Pyemotidae)，以及疥蟎科(Sarcoptidae)的瘡蟎及蟎蟲；以及直翅目(Orthoptera)的卵、成蟲以及不成熟的蟲，包括蚱蜢、蝗蟲，以及蟋蟀（例如，遷徙蚱蜢（例如，*Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas）、美國蚱蜢（例如，*Schistocerca americana* Drury）、沙漠蝗蟲(*Schistocerca gregaria* Forskal)、遷徙蝗蟲(*Locusta migratoria* Linnaeus)、灌木蝗蟲(*Zonocerus* spp.)、家蟋蟀 (*Acheta domesticus* Linnaeus)、螻蛄（例如，褐黃螻蛄(*Scapteriscus vicinus* Scudder)以及南方螻蛄(*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)）；雙翅目(Diptera)昆蟲的蟲卵、成蟲、幼蟲，包括潛葉蟲（例如，美洲斑潛蠅*Liriomyza* spp.例如紋石菜葉斑潛蠅(*Liriomyza sativae* Blanchard)）、吸血蠓、果蠅(實蠅科Tephritidae)、麥稈蠅（例如，黑麥稈蠅*Oscinella frit* Linnaeus）、土蛆、家蠅（例如，普通家蠅*Musca domestica* Linnaeus）、小家蠅（例如，夏廁蠅*Fannia canicularis* Linnaeus、股廁蠅*F. femoralis*

Stein) 、 廐蠅 (例如 , 螫蠅 *Stomoxys calcitrans* Linnaeus) 、 秋家蠅、角蠅、麗蠅 (例如 , 麗蠅 *Chrysomya* spp. 、 伏蠅 *Phormia* spp.) , 以及其他的食肉飛蟲、馬蠅 (例如 , 馬蠅 *Tabanus* spp.) 、 膚蠅 (例如 , 馬胃蠅 *Gastrophilus* spp. 、 羊狂蠅 *Oestrus* spp.) 、 牛皮蠅 (例如 , *Hypoderma* spp.) 、 鹿蠅 (e.g., 斑虻 *Chrysops* spp.) 、 羊蜚蠅 (e.g., 綿羊大吸血昆蟲 (*Melophagus ovinus* Linnaeus)) , 以及其他短角亞目 (*Brachycera*) , 蚊子 (例如 , 埃及斑蚊 (*Aedes* spp.) 、 瘧蚊 (*Anopheles* spp.) 、 家蚊 (*Culex* spp.)) 、 黑蠅 (例如 , 原蚋 (*Prosimulium* spp.) 、 蚋 (*Simulium* spp.)) 、 小黑蚊、沙蠅、黑翅蕈蠅 , 以及其他長角亞目 (*Nematocera*) ; 纓翅目 (*Thysanoptera*) 昆蟲的卵、成蟲、幼蟲 , 包括洋蔥薊馬 (*Thrips tabaci* Lindeman) 、 花薊馬 (*Frankliniella* spp.) , 以及其他葉面薊馬 ; 膜翅目 (*Hymenoptera*) 昆蟲害蟲包括蟻科 (*Formicidae*) 的螞蟻 , 包括佛羅里達木匠螞蟻 (*Camponotus floridanus* Buckley) 、 紅木匠螞蟻 (*Camponotus ferrugineus* Fabricius) 、 黑木匠螞蟻 (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer) 、 白腳螞蟻 (*Technomyrmex albipes* fr. Smith) 、 大頭螞蟻 (*Pheidole* sp.) 、 鬼螞蟻 (*Tapinoma melanocephalum* Fabricius) ; 法老螞蟻 (*Monomorium pharaonis* Linnaeus) 、 小火蟻 (*Wasmannia auropunctata* Roger) 、 火蟻 (*Solenopsis geminata* Fabricius) 、 紅色進口火蟻 (*Solenopsis invicta* Buren) 、 阿根廷螞蟻 (*Iridomyrmex humilis* Mayr) 、 瘋蟻 (*Paratrechina longicornis* Latreille) 、 鋪道蟻 (*Tetramorium caespitum* Linnaeus) 、 玉米田蟻 (*Lasius alienus* Förster) , 以及臭家蟻 (*Tapinoma sessile* Say) 。 其他膜翅目 (*Hymenoptera*) 包含蜜蜂 (包括木蜂) 、 大黃蜂、小黃蜂、胡蜂 , 以及鋸蠅 (*Neodiprion* spp. ; *Cephus* spp.) ; 等翅目 (*Isoptera*) 的昆蟲害蟲包括在白蟻科 (*Termitidae*) (例如 , 大白蟻 *Macrotermes* sp., 胖土白蟻 *Odontotermes obesus* Rambur) 、 木白蟻科 (*Kalotermitidae*) (例如 , 幹木白蟻 *Cryptotermes* sp.) ,

以及鼻白蟻科(Rhinotermitidae) (例如, *Reticulitermes* sp., *Coptotermes* sp., *Heterotermes tenuis* Hagen) 的白蟻, 東部地下白蟻(*Reticulitermes flavipes* Kollar)、西部地下白蟻(*Reticulitermes hesperus* Banks)、台灣地下白蟻 (*Coptotermes formosanus* Shiraki)、西印度乾木白蟻(*Incisitermes immigrans* Snyder)、粉末後白蟻(*Cryptotermes brevis* Walker)、乾木白蟻(*Incisitermes snyderi* Light)、東南部地下白蟻(*Reticulitermes virginicus* Banks)、西部乾木白蟻(*Incisitermes minor* Hagen)、樹棲白蟻, 例如象白蟻(*Nasutitermes* sp.), 以及其他具有經濟重要性的白蟻; 纓尾目(Thysanura)的昆蟲害蟲包括銀魚(*Lepisma saccharina* Linnaeus)以及斑衣魚(*Thermobia domestica* Packard)。其他節肢動物害蟲包括: 在蜘蛛目(Araneae)的蜘蛛, 例如棕色隱士蜘蛛(*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik)以及黑寡婦蜘蛛(*Latrodectus mactans* Fabricius), 以及在蚰蜒目(Scutigeroforma)的蜈蚣, 例如家蜈蚣 (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus)。

【0335】 存儲穀物的無脊椎害蟲的實例包括, 大粒螟(*Prostephanus truncatus*)、小粒螟(*Rhyzopertha dominica*)、水稻象鼻蟲(*Stiophilus oryzae*)、玉米象鼻蟲(*Stiophilus zeamais*)、豇豆象鼻蟲(*Callosobruchus maculatus*)、紅麵粉甲蟲(*Tribolium castaneum*)、糧倉象鼻蟲(*Stiophilus granarius*)、印度蛾(*Plodia interpunctella*)、地中海麵粉甲蟲(*Ephesia kuhniella*), 以及扁平或生鏽穀物甲蟲(*Cryptolestis ferrugineus*)。

【0336】 本發明之化合物具有對抗鱗翅目(Lepidoptera)害蟲之活性, 鱗翅目害蟲包括: 例如, *Alabama argillacea* Hübner (棉葉蟲)、*Archips argyrospila* Walker (果樹捲葉蛾)、*A. rosana* Linnaeus (歐洲捲葉蛾), 以及其他黃捲葉蛾屬(*Archips*)物種, *Chilo suppressalis* Walker (水稻螟蟲)、*Cnaphalocrosis medinalis*

Guenée (水稻捲葉蟲)、*Crambus caliginosellus* Clemens (玉米根結網毛蟲)、*Crambus teterrellus* Zincken (藍草結網毛蟲)、*Cydia pomonella* Linnaeus (蘋果蠹蛾)、*Earias insulana* Boisduval (刺狀棉鈴蟲)、*Earias vittella* Fabricius (斑點棉鈴蟲)、*Helicoverpa armigera* Hübner (美國棉鈴蟲)、*Helicoverpa zea* Boddie (玉米穗蟲)、*Heliothis virescens* Fabricius (煙草夜蛾)、*Herpetogramma licarsisalis* Walker (草皮結網毛蟲)、*Lobesia botrana* Denis & Schiffermüller (葡萄漿果蛾)、*Pectinophora gossypiella* Saunders (粉紅鈴蟲)、*Phyllocnistis citrella* Stainton (柑橘葉蟬)、*Pieris brassicae* Linnaeus (大白蝴蝶)、*Pieris rapae* Linnaeus (小白蝴蝶)、*Plutella xylostella* Linnaeus (小菜蛾)、*Spodoptera exigua* Hübner (甜菜夜蛾)、*Spodoptera litura* Fabricius (煙草夜蛾、叢生毛蟲)、*Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (秋行軍蟲)、*Trichoplusia ni* Hübner (甘藍擬尺蠖)以及*Tuta absoluta* Meyrick (番茄葉蟬)。

【0337】本發明之化合物具有抗同翅目(Homoptera)害蟲之活性，同翅目害蟲包括：*Acyrtosiphon pisum* Harris (豌豆蚜蟲)、*Aphis craccivora* Koch (豇豆蚜蟲)、*Aphis fabae* Scopoli (黑豆蚜蟲)、*Aphis gossypii* Glover (棉花蚜蟲、甜瓜蚜蟲)、*Aphis pomi* De Geer (蘋果蚜蟲)、*Aphis spiraecola* Patch (繡線菊蚜蟲)、*Aulacorthum solani* Kaltenbach (毛地黃蚜蟲)、*Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (草莓蚜蟲)、*Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (俄羅斯小麥蚜蟲)、*Dysaphis plantaginea* Paaserini (玫瑰蘋果蚜蟲)、*Eriosoma lanigerum* Hausmann (羊毛蘋果蚜蟲)、*Hyalopterus pruni* Geoffroy (粉狀梅花蚜蟲)、*Lipaphis erysimi* Kaltenbach (蘿蔔蚜蟲)、*Metopolophium dirrhodum* Walker (穀類蚜蟲)、*Macrosiphum euphorbiae* Thomas (馬鈴薯蚜蟲)、*Myzus persicae* Sulzer (桃蚜、綠桃蚜蟲)、*Nasonovia*

ribisnigri Mosley (萵苣蚜蟲)、Pemphigus spp. (根蚜蟲與癭蚜蟲)、Rhopalosiphum maidis Fitch (玉米葉蚜蟲)、Rhopalosiphum padi Linnaeus (烏櫻桃燕麥蚜蟲)、Schizaphis graminum Rondani (綠蟲)、Sitobion avenae Fabricius (長角麥蚜)、Therioaphis maculata Buckton (斑點苜蓿蚜蟲)、Toxoptera aurantii Boyer de Fonscolombe (黑柑橘蚜蟲)、以及Toxoptera citricida Kirkaldy (棕色柑橘蚜蟲)；Adelges spp. (球蚜)；Phylloxera devastatrix Pergande (美國山核桃根瘤蚜)；Bemisia tabaci Gennadius (煙草粉蝨、甘藷粉蝨、Bemisia argentifolii Bellows & Perring (銀葉粉蝨)、Dialeurodes citri Ashmead (柑橘粉蝨)以及Trialeurodes vaporariorum Westwood (溫室粉蝨)；Empoasca fabae Harris (馬鈴薯葉蟬)、Laodelphax striatellus Fallen (較小的褐飛蝨)、Macrolestes quadrilineatus Forbes (紫菀葉蟬)、Nephotettix cincticeps Uhler (綠葉蟬)、Nephotettix nigropictus Stål (稻葉蟬)、Nilaparvata lugens Stål (褐飛蝨)、Peregrinus maidis Ashmead (玉米飛蝨)、Sogatella furcifera Horvath (白背飛蝨)、Sogatodes orizicola Muir (稻米飛蝨)、Typhlocyba pomaria McAtee (白蘋果葉蟬)、Erythroneoura spp. (葡萄葉蟬)；Magicidada septendecim Linnaeus (週期蟬)；Icerya purchasi Maskell (吹綿介殼蟲)、Quadraspidotus perniciosus Comstock (梨齒盾介殼蟲)；Planococcus citri Risso (柑橘粉蚧)；Pseudococcus spp. (其他粉蚧複合體)；Cacopsylla pyricola Foerster (梨木蝨)、Trioza diospyri Ashmead (柿木蝨)。

【0338】本發明之化合物具有抗半翅目(Hemiptera)害蟲之活性，半翅目害蟲包括：Acrosternum hilare Say (綠臭蟲)、Anasa tristis De Geer (南瓜蟲)、Blissus leucopterus leucopterus Say (麥虱)、Cimex lectularius Linnaeus (床蝨) Corythuca gossypii Fabricius (棉網蝽)、Cyrtopeltis modesta Distant (番茄蝽)、Dysdercus

suturellus Herrich-Schäffer (污棉蝽)、Euchistus servus Say (褐椿象)、Euchistus variolarius Palisot de Beauvois (單斑蝽)、Graptosthetus spp. (種子蟲複合物)、Halymorpha halys Stål (茶翅蝽)、Leptoglossus corculus Say (松葉根蝽)、Lygus lineolaris Palisot de Beauvois (牧草盲椿)、Nezara viridula Linnaeus (角肩椿象)、Oebalus pugnax Fabricius (稻椿象)、Oncopeltus fasciatus Dallas (小乳草長蝽)、Pseudatomoscelis seriatus Reuter (棉盲蝽)。由本發明之化合物控制的其他昆蟲目包括纓翅目(Thysanoptera) (例如, Franklioniella occidentalis Pergande (西部花薊馬)、Scirtothrips citri Moulton (柑橘薊馬)、Sericothrips variabilis Beach (黃豆薊馬)、及Thrips tabaci Lindeman (洋蔥薊馬)) ; 以及鞘翅目(Coleoptera) (例如, Leptinotarsa decemlineata Say (科羅拉多馬鈴薯甲蟲)、Epilachna varivestis Mulsant (墨西哥豆甲蟲)以及叩頭蟲科Agriotes屬、Athous屬, 或Limonium屬的線蟲)。

【0339】 值得注意的是使用本發明之化合物來防治小菜蛾(*Plutella xylostella*)之用途。值得注意的是使用本發明之化合物來防治秋行軍蟲(*Spodoptera frugiperda*)之用途。值得注意的是本發明之化合物用於防治西部花薊馬(*Franklioniella occidentalis*)之用途。值得注意的是使用本發明之化合物來防治馬鈴薯葉蟬(*Empoasca fabae*)之用途。值得注意的是本發明之化合物用於防治玉米飛蟲(*Peregrinus maidis*)之用途。值得注意的是使用本發明之化合物來防治棉花蚜蟲(*Aphis gossypii*)之用途。值得注意的是使用本發明之化合物來防治桃蚜(*Myzus persicae*)之用途。值得注意的是使用本發明之化合物來防治甘藷粉蝨(*Bemisia tabaci*)之用途。

【0340】 本發明之化合物也可用於增加作物植物的活力。該方法包含使作物植物（例如，葉子、花、果實或根）或種植作物的種子與式1之化合物接觸，其量足以達到所需的植物活力效果（即，一生物有效量）。通常，式1之化合物以配製的組合物施用。雖然式1之化合物通常直接施用於作物植物或其種子，但它也可以施用於作物植物的所在地，即作物植物的環境，特別是環境的一部分，足夠接近使式1之化合物遷移到作物植物中。與該方法相關的地點最通常包含生長培養基(即，對植物提供養分的培養基)，通常為植物生長的土壤。因此，處理作物植物以增加作物植物的活力包含使作物植物、種植作物植物的種子，或作物植物的所在地與一生物有效量的式1之化合物接觸。

【0341】 增加的作物活力可導致下列一種或多種觀察到的影響：**(a)**透過優良的種子萌發，作物出苗以及作物站立證明最佳作物建立；**(b)**透過快速及穩健的葉子生長（例如，透過葉面積指數測量），植物高度，分蘗數（例如，用於稻米），根質量，以及作物營養體的總乾重所證明的增加的作物生長；**(c)**透過開花時間，開花持續時間，花朵數量，總生物量積累（即，產量）及/或產品的果實或穀物等級可銷售性（即，產量品質）證明，提高了作物產量；**(d)**提高作物抵禦或預防植物病害感染和節肢動物，線蟲或軟體動物蟲害的能力；以及**(e)**作物承受環境壓力的能力增強，例如暴露於極端溫度，次佳水分或植物毒性化學物質。

【0342】 與未處理的植物相比，透過殺死或以其他方式防止植物環境中的植食性無脊椎害蟲的攝食，本發明之化合物可以增加處理植物的活力。在沒有對植食性無脊椎害蟲進行這種防治的情況下，害蟲透過消耗植物組織或樹液或傳播植物病原體，如病毒，來降低植物活力。即使在沒有植食性無脊椎害蟲的情況下，本發明之化合物也可透過改變植物的代謝來增加植物的活力。通常，如果植

物在非理想環境中生長，即包含不利於植物達成在理想的環境中能展現完全遺傳潛力的一個或多個方面的環境，則透過以本發明之化合物處理植物將極大地增加作物植物的活力。

【0343】 值得注意的是，增加作物植物活力之方法，其中該作物植物在包含植食性無脊椎害蟲的環境中生長。還值得注意的是，增加作物植物活力之方法，其中該作物植物在不包含植食性無脊椎害蟲的環境中生長。還值得注意的是，增加作物植物活力之方法，其中該作物植物在包含少於理想的水分量的環境中生長，以支持作物植物的生長。值得注意的是，增加作物植物活力之方法，其中該作物為稻米。還值得注意的是，增加作物植物活力之方法，其中該作物為玉蜀黍（玉米）。還值得注意的是，增加作物植物活力之方法，其中該作物為大豆。

【0344】 本發明之化合物還可與一種或多種其他生物活性化合物或試劑混合，包括殺蟲劑、殺真菌劑、殺線蟲劑、殺菌劑、殺蟎劑、除草劑、除草劑安全劑、生長調節劑，如昆蟲蛻皮抑制劑以及生根興奮劑、化學絕育劑、化學信息素、驅蟲劑、引誘劑、信息素、餵養興奮劑，其他生物活性化合物或昆蟲病原細菌、病毒或真菌形成多組成分農藥，提供更廣泛的農業及非農業用途。因此，本發明還涉及包含一生物有效量的式1之化合物，至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑，以及液體稀釋劑所組成之群組的額外組成分之組合物，以及至少一種額外的生物活性化合物或試劑。對於本發明之混合物，其他生物活性化合物或試劑可與本發明之化合物（包括式1之化合物）一起配製以形成預混物，或者，該其它生物活性化合物或試劑可與本發明之化合物，包括式1之化合物，分開配製，且兩種製劑在施用前（例如，在噴霧罐中）組合在一起，或者，相繼地、連續施用。

【0345】可與本發明之化合物配製的此類生物活性化合物或試劑之實施例為殺蟲劑，例如阿巴汀(abamectin)、歐殺松(acephate)、亞醜蟎(acequinocyl)、亞滅培(acetamiprid)、阿納寧(acrinathrin)、雙丙環蟲酯(afidopyropen) [(3S,4R,4aR,6S, 6aS,12R,12aS,12bS)-3-[(環丙基羰基)氧基]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氫-6,12-二羥基-4,6a,12b-三甲基-11氧代-9-(3-吡啶基)-2H,11H-萘並[2,1-b]吡喃並[3,4-e]吡喃-4-基]甲基環丙烷羧酸酯)、磺胺蟎酯(amidoflumet)、三亞蟎(amitraz)、阿維菌素(avermectin)、印楝素(azadirachtin)、谷速松(azinphos-methyl)、免扶克(benfuracarb)、免速達(bensultap)、畢芬寧(bifenthrin)、必芬蟎(bifenazate)、雙三氟蟲脲(bistrifluron)、硼酸(borate)、布芬淨(buprofezin)、硫線磷(cadusafos)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、培丹(cartap)、伐蟲脛(carzol)、剋安勃(chlorantraniliprole)、克凡派(chlorfenapyr)、克福隆(chlorfluazuron)、陶斯松(chlorpyrifos)、甲基陶斯松(chlorpyrifos-methyl)、可芬諾(chromafenozide)、克芬(clofentezin)、可尼丁(clothianidin)、賽安勃(cyantraniliprole) (3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1H-吡啶-5-甲醯胺)、環溴蟲醯胺(cyclaniliprole) (3-溴-N-[2-溴-4-氯-6-[[[(1-環丙基乙基)胺基]羰基]苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡啶-5-甲醯胺)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、環氧蟲啉(cycloxaprid) ((5S,8R)-1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2,3,5,6,7,8-六氫-9-硝基-5,8-環氧-1H-咪啶並[1,2-a]氮雜卓)、賽芬蟎(cyflumetofen)、賽扶寧(cyfluthrin)、貝他賽扶寧(beta-cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、伽瑪賽洛寧(gamma-cyhalothrin)、高效賽洛寧(lambda-cyhalothrin)、賽滅寧(cypermethrin)、亞滅寧(alpha-cypermethrin)、傑他賽滅寧(zeta-cypermethrin)、賽滅淨(cyromazine)、第滅寧(deltamethrin)、汰芬隆(diafenthiuron)、

大利松(diazinon)、地特靈(dieldrin)、二福隆(diflubenzuron)、四氟甲醚菊酯(dimefluthrin)、殺蟲雙(dimehypo)、大滅松(dimethoate)、達特南(dinotefuran)、茂醚(diofenolan)、因滅汀(emamectin)、安殺番(endosulfan)、益化利(esfenvalerate)、益斯普(ethiprole)、依芬寧(etofenprox)、依殺蟎(etoxazole)、芬佈賜(fenbutatin oxide)、撲滅松(fenitrothion)、芬硫克(fenothiocarb)、芬諾克(fenoxycarb)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、芬普尼(fipronil)、氟麥托醌(flometoquin) (2-乙基-3,7-二甲基-6-[4-(三氟甲氧基)苯氧基]-4-喹啉基甲基碳酸酯)、氟尼胺(flonicamid)、氟大滅(flubendiamide)、護賽寧(flucythrinate)、嘧蟲胺(flufenerim)、氟芬隆(flufenoxuron)、氟菌蟎酯(flufenoxystrobin) (甲基(α E)-2-[[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]甲基]- α -(甲氧基亞甲基)苯乙酸)、氟速芬(flufensulfone) (5-氯-2-[(3,4,4-三氟-3-丁烯-1-基)磺醯基]噻唑)、氟基硫醚類殺蟲劑 fluhexafon、氟派瑞(fluopyram)、丁烯氟蟲腈(flufiprole) (1-[2,6-二氯-4-(三氟甲基)苯基]-5-[(2-甲基-2-丙烯-1-基)胺基]-4-[(三氟甲基)亞硫醯基]-1H-吡唑-3-腈)、氟吡呋喃酮(flupyradifurone) (4-[[6-氯-3-吡啶基]甲基](2,2-二氟乙基)胺基]-2-(5H)-呋喃酮)、福化利(flualinate)、淘福化利(tau-flualinate)、大福松(fonophos)、覆滅蟎(formetanate)、福賽絕(fosthiazate)、合芬隆(halofenozide)、擬除蟲菊酯類殺蟲劑 heptafluthrin ([2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苯基]甲基2,2-二甲基-3-[(1Z)-3,3,3-三氟-1-丙烯-1-基]環丙烷羧酸酯)、六伏隆(hexaflumuron)、合賽多(hexythiazox)、愛美松(hydramethylnon)、益達胺(imidacloprid)、因得克(indoxacarb)、殺蟲皂(insecticidal soaps)、亞芬松(isofenphos)、祿芬隆(lufenuron)、馬拉松(malathion)、氯氟醚菊酯(meperfluthrin) ([2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苯基]甲基(1R, 3S)-3-(2,2-二氯乙基)-2,2-二甲基環丙烷羧酸酯)、美氟綜(metaflumizone)、聚乙醛

(metaldehyde)、達馬松(methamidophos)、滅大松(methidathion)、滅蟲威(methiodicarb)、納乃得(methomyl)、美賜平(methoprene)、甲氧DDT(methoxychlor)、美特寧(metofluthrin)、滅芬諾(methoxyfenozide)、美特寧(metofluthrin)、亞素靈(monocrotophos)、殺蟲劑monofluorothrin ([2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苯基]甲基 3-(2-氰基-1-丙烯-1-基)-2,2-二甲基環丙烷羧酸甲酯)、尼古丁(nicotine)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、硝蟲噻嗪(nithiazine)、諾伐隆(novaluron)、諾福隆(noviflumuron)、毆殺滅(oxamyl)、巴拉松(parathion)、甲基巴拉松(parathion-methyl)、百滅寧(permethrin)、福瑞松(phorate)、裕必松(phosalone)、益滅松(phosmet)、福賜米松(phosphamidon)、比加普(pirimicarb)、佈飛松(profenofos)、普亞列寧(profluthrin)、毆蟎多(propargite)、普羅三芬丁酯(protrifenbute)、甲醯苯胺類殺蟎劑pyflubumide (1,3,5-三甲基-N-(2-甲基-1-氧代丙基)-N-[3-(2-甲基丙基)-4-[2,2,2-三氟-1-甲氧基-1-(三氟甲基)乙基]苯基]-1H-吡啶-4-甲醯胺)、派滅淨(pymetrozine)、吡嗪氟蟲脞(pyrafluprole)、除蟲菊精(pyrethrin)、畢達本(pyridaben)、三氟甲吡啶(pyridalyl)、新啞啞啞類殺蟲劑pyrifluquinazon、嘧蟎胺(pyriminostrobin) (甲基 (α E)-2-[[[2-[(2,4-二氯苯基)胺基]-6-(三氟甲基)-4-嘧啶基]氧基]甲基]- α -(甲氧基亞甲基)苯乙酸酯)、皮瑞羅(pyriprole)、百利普芬(pyriproxifen)、魚藤酮(rotenone)、魚尼丁(ryanodine)、矽護芬(silafluofen)、賜諾特(spinetoram)、多殺菌素(spinosad)、賜派芬(spirodiclofen)、賜滅芬(spiromesifen)、賜派滅(spirotetramat)、硫丙磷(sulprofos)、速殺氟(sulfoxaflor) (N-[甲氧基環[1-[6-(三氟甲基)-3-吡啶基]乙基]- λ^4 -硫雜環丁烷]氮脞)、得芬諾(tebufenozide)、得芬瑞(tebufenpyrad)、得福隆(teflubenzuron)、七氟菊酯(tefluthrin)、托福松(terbufos)、四氯松(tetrachlorvinphos)、治滅寧(tetramethrin)、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin) ([2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苯基]

甲基2,2,3,3-四甲基環丙烷羧酸酯)、氟氰蟲醯胺(tetraniliprole)、賽果培(thiacloprid)、賽速安(thiamethoxam)、硫敵克(thiodicarb)、殺蟲雙(thiosultap-sodium)、殺線蟲劑tioxazafen (3-苯基-5-(2-噻吩基)-1,2,4-惡二唑)、脫芬瑞(tolfenpyrad)、泰滅寧(tralomethrin)、啞蚜威(triazamate)、三氯松(trichlorfon)、三氟苯嘧啶(triflumezopyrim) (2,4-二氧代-1-(5-嘧啶基甲基)-3-[3-(三氟甲基)苯基]-2H-吡啶並[1,2-a]嘧啶內鹽)、殺蟲隆(triflumuron)、蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*) δ -內毒素、昆蟲病原細菌、昆蟲病原病毒，以及昆蟲病原真菌。

【0346】值得注意的是殺蟲劑，例如阿巴汀(abamectin)、亞滅培(acetamiprid)、阿納寧(acrinathrin)、雙丙環蟲酯(afidopyropen)、三亞蟎(amitraz)、阿維菌素(ivermectin)、印棟素(azadirachtin)、免扶克(benfuracarb)、免速達(bensultap)、畢芬寧(bifenthrin)、布芬淨(buprofezin)、硫線磷(cadusafos)、加保利(carbaryl)、培丹(cartap)、剋安勃(chlorantraniliprole)、克凡派(chlorfenapyr)、陶斯松(chlorpyrifos)、可尼丁(clothianidin)、賽安勃(cyantraniliprole)、環溴蟲醯胺(cyclaniliprole)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、貝他賽扶寧(beta-cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、伽瑪賽洛寧(gamma-cyhalothrin)、高效賽洛寧(lambda-cyhalothrin)、賽滅寧(cypermethrin)、亞滅寧(alpha-cypermethrin)、傑他賽滅寧(zeta-cypermethrin)、賽滅淨(cyromazine)、第滅寧(deltamethrin)、地特靈(dieldrin)、達特南(dinotefuran)、茂醚(diofenolan)、因滅汀(emamectin)、安殺番(endosulfan)、益化利(esfenvalerate)、益斯普(ethiprole)、依芬寧(etofenprox)、依殺蟎(etoxazole)、撲滅松(fenitrothion)、芬硫克(fenothiocarb)、芬諾克(fenoxycarb)、芬化利(fenvalerate)、芬普尼(fipronil)、氟麥托醯(flometoquin)、氟尼胺(flonicamid)、氟大滅(flubendiamide)、氟芬隆(flufenoxuron)、氟菌蟎酯(flufenoxystrobin)、氟速

芬(flufensulfone)、丁烯氟蟲腈(flufiprole)、氟吡呋喃酮(flupyradifurone)、福化利(fluvalinate)、覆滅蟎(formetanate)、福賽絕(fosthiazate)、擬除蟲菊酯類殺蟲劑 heptafluthrin、六伏隆(hexaflumuron)、愛美松(hydramethylnon)、益達胺(imidacloprid)、因得克(indoxacarb)、祿芬隆(lufenuron)、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、美氟綜(metaflumizone)、滅蟲威(methiodicarb)、納乃得(methomyl)、美賜平(methoprene)、滅芬諾(methoxyfenozide)、美特寧(metofluthrin)、殺蟲劑monofluorothrin、烯啶蟲胺(nitenpyram)、硝蟲噻嗪(nithiazine)、諾伐隆(novaluron)、毆殺滅(oxamyl)、甲醯苯胺類殺蟎劑pyflubumide、派滅淨(pymetrozine)、除蟲菊精(pyrethrin)、畢達本(pyridaben)、三氟甲吡醚(pyridalyl)、嘧蟎胺(pyriminostrobin)、百利普芬(pyriproxyfen)、魚尼丁(ryanodine)、賜諾特(spinetoram)、多殺菌素(spinosad)、賜派芬(spirodiclofen)、賜滅芬(spiromesifen)、賜派滅(spirotetramat)、速殺氟(sulfoxaflor)、得芬諾(tebufenozide)、治滅寧(tetramethrin)、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)、賽果培(thiacloprid)、賽速安(thiamethoxam)、硫敵克(thiodicarb)、殺蟲雙(thiosultap-sodium)、泰滅寧(tralomethrin)、啞蚜威(triazamate)、三氟苯嘧啶(triflumezopyrim)、殺蟲隆(triflumuron)、蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*) δ -內毒素、蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)的所有菌株，以及所有核多角體病毒株。

【0347】用於與本發明之化合物混合的生物製劑的一具體實施例包括昆蟲病原細菌，例如蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)，包埋的蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*) δ -內毒素，例如以CellCap[®]程序製備的MVP[®]以及MVPII[®]生物殺蟲劑(CellCap[®]、MVP[®]以及MVPII[®]為Mycogen公司的商標，印第安納州，美國)；昆蟲病原真菌，如綠色的硬化病(musccardine)真菌；以及昆蟲病原(包括天然存在

的與遺傳修飾的)病毒，包括桿狀病毒、核多角體病毒(nucleopolyhedro virus，NPV)，如玉米穗夜蛾核多角體病毒(Helicoverpa zea nucleosidepolyhedrovirus，HzNPV)、芹菜葉蛾核多角體病毒(Anagrapha falcifera nucleopolyhedrovirus，AfNPV)；以及顆粒體病毒(granulosis virus，GV)，例如蘋果蠹蛾顆粒體病毒(Cydia pomonella granulosis virus，CpGV)。

【0348】特別值得注意的是這樣的組合，其中另一種無脊椎害蟲防治活性成分屬於與式1之化合物不同的化學類別或具有不同的作用位點。於某些情況下，與至少一種其他無脊椎害蟲防治活性成分的組合具有相似的防治範圍但作用區域不同，對於抗性管理將是特別有利的。因此，本發明之組合物可進一步包含一生物有效量的至少一種額外的無脊椎害蟲防治活性成分，其具有相似的對照範圍但屬於不同的化學類別或具有不同的作用位點。這些額外的生物活性化合物或試劑包括，但不限於，乙醯膽鹼酯酶(acetylcholinesterase，AChE)抑制劑，如胺甲酸酯化合物，納乃得(methomyl)、毆殺滅(oxamyl)、硫敵克(thiodicarb)、啞蚜威(triazamate)，以及有機磷酸鹽陶斯松(chlorpyrifos)；GABA-氯離子通道的拮抗物例如環狀二烯烴類化合物地特靈(dieldrin)與安殺番(endosulfan)，以及苯基吡啶類化合物益斯普(ethiprole)以及芬普尼(fipronil)；鈉通道調節劑如擬除蟲菊酯，畢芬寧(bifenthrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、貝他賽扶寧(beta-cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、高效賽洛寧(lambda-cyhalothrin)、賽滅寧(cypermethrin)、第滅寧(deltamethrin)、四氟甲醚菊酯(dimefluthrin)、益化利(esfenvalerate)、美特寧(metofluthrin)以及普亞列寧(profluthrin)；菸鹼型乙醯膽鹼受體(nicotinic acetylcholinereceptor，nAChR)激動劑如新菸鹼類殺蟲劑，亞滅培(acetamiprid)、可尼丁(clothianidin)、達特南(dinotefuran)、益達胺(imidacloprid)、烯啶蟲胺

(nitenpyram)、硝蟲噻嗪(nithiazine)、賽果培(thiacloprid)，以及賽速安(thiamethoxam)，以及速殺氟(sulfoxaflor)；菸鹼型乙醯膽鹼受體(nicotinic acetylcholine receptor, nAChR)變構活化劑如多殺菌素，賜諾特(spinetoram)以及多殺菌素(spinosad)；氯離子通道活化劑如阿維菌素(avermectins)，阿巴汀(abamectin)以及因滅汀(emamectin)；青春素模擬劑如茂醚(diofenolan)、美賜平(methoprene)、芬諾克(fenoxycarb)以及百利普芬(pyriproxyfen)；選擇性同翅目昆蟲進食阻滯劑，如派滅淨(pymetrozine)以及氟尼胺(flonicamid)；蟎生長抑制劑如依殺蟎(etoxazole)；線粒體ATP合成酶抑制劑如毆蟎多(propargite)；經由破壞質子梯度來解耦氧化磷酸化，如克凡派(chlorfenapyr)；菸鹼乙醯膽鹼受體(nicotinic acetylcholine receptor, nAChR)通道阻斷劑，如沙蠶毒素類似物，培丹(cartap)；甲殼素生合成抑制劑如苯甲醯尿素類(benzoylureas)，氟芬隆(flufenoxuron)、六伏隆(hexaflumuron)、祿芬隆(lufenuron)、諾伐隆(novaluron)、諾福隆(noviflumuron)以及殺蟲隆(triflumuron)，以及布芬淨(buprofezin)；雙翅目蛻皮破壞劑如賽滅淨(cyromazine)；蛻皮激素受體激動劑如二醯基聯氨類(diacylhydrazines)，滅芬諾(methoxyfenozide)以及得芬諾(tebufenozide)；章魚胺受體激動劑如三亞蟎(amitraz)；線粒體複合物III電子傳遞抑制劑如愛美松(hydramethylnon)；線粒體複合物I電子傳遞抑制劑如畢達本(pyridaben)；電壓依賴性鈉通道阻斷劑如因得克(indoxacarb)；乙醯輔酶A羧化酶抑制劑，如特窗酸及帖唑咪酸衍生物，賜派芬(spirodiclofen)、賜滅芬(spiromesifen)以及賜派滅(spirotetramat)；線粒體複合物II電子轉運抑制劑，如 β -酮腈類，賽派芬(cyenopyrafen)以及賽芬蟎(cyflumetofen)；脘類受體調節劑如氨茴酸二醯胺化合物，剋安勃(chlorantraniliprole)、賽安勃(cyantraniliprole)以及賽安勃(cyantraniliprole)，二醯胺化合物如氟大滅

(flubendiamide)，以及魚尼丁(ryanodine)受體配體如魚尼丁(ryanodine)；其中負責生物活性的目標位點為未知或未表徵的化合物，例如印楝素(azadirachtin)、必芬蟎(bifenazate)、三氟甲吡啶(pyridalyl)、新啞啞啞類殺蟲劑pyrifluquinazon以及三氟苯嘧啶(triflumezopyrim)；昆蟲中腸膜的微生物破壞劑如蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)及其所產生的 δ -內毒素，以及圓形芽孢桿菌(*Bacillus sphaericus*)；以及生物製劑，包括核多角體病毒(NPV)與其他天然存在的或基因改造的殺蟲病毒。

【0349】可與本發明之化合物配製的生物活性化合物或試劑之其他實施例為：殺真菌劑，例如噻二唑素S-甲基(acibenzolar-S-methyl)、殺螟丹(aldimorph)、滅脫定(ametocradin)、安美速(amisulbrom)、敵菌靈(anilazine)、戊環唑(azaconazole)、亞托敏(azoxystrobin)、本達樂(benalaxyl)(包括本達樂-M(benalaxyl-M))、麥銹靈(benodanil)、免賴得(benomyl)、苯噻菌胺酯(benthiavalicarb)(包括苯噻菌胺酯-異丙基(benthiavalicarb-isopropyl))、苯並烯氟菌唑(benzovindiflupyr)、貝斯氧雜嗪(bethoxazin)、百克蟎(binapacryl)、聯苯(biphenyl)、比多農(bitertanol)、聯苯吡菌胺(bixafen)、保米黴素(blasticidin-S)、白克列(boscalid)、溴克座(bromuconazole)、布瑞莫(bupirimate)、得滅多(buthiobate)、菱銹靈(carboxin)、加普胺(carpropamid)、四氯丹(captafol)、蓋普丹(captan)、鋅錳乃浦(carbendazim)、地茂丹(chloroneb)、四氯異苯睛(chlorothalonil)、克氯得(chlozolinate)、氫氧化銅、氯氧化銅、硫酸銅、丁香菌酯(coumoxystrobin)、賽座滅(cyazofamid)、賽芬胺(cyflufenamid)、克絕(cymoxanil)、環克座(cyproconazole)、賽普洛(cyprodinil)、益發靈(dichlofluanid)、雙氯氰菌胺(diclocymet)、達滅淨(diclomezine)、大克爛(dicloran)、乙黴威(diethofencarb)、待克利(difenoconazole)、二氟林(diflumetorim)、

甲菌啉(dimethirimol)、達滅芬(dimethomorph)、醚菌胺(dimoxystrobin)、達克利(diniconazole) (包括達克利-M (diniconazole-M))、白粉克(dinocap)、腈硫醯(dithianon)、二硫雜環戊烷類(dithiolanes)、十二環嗎啉(dodemorph)、多寧(dodine)、滅癬(econazole)、乙環唑(etaconazole)、護粒松(edifenphos)、稀月虧菌酯(enoxastrobin) (亦稱為烯肱菌酯(enestroburin))、依普座(epoxiconazole)、噻唑菌胺(ethaboxam)、依瑞莫(ethirimol)、依得利(etridiazole)、凡殺同(famoxadone)、咪唑菌酮(fenamidone)、烯肱菌胺(fenaminstrobin)、芬瑞莫(fenarimol)、芬克座(fenbuconazole)、甲呋醯胺(fenfuram)、環醯菌胺(fenhexamide)、芬諾尼(fenoxanil)、拌種咯(fenpiclonil)、苯銹啉(fenpropidin)、芬普福(fenpropimorph)、胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)、三苯醋錫(fentin acetate)、三苯基氫氧化錫(fentin hydroxide)、富爾邦(ferbam)、富米綜(ferimzone)、氟麥托醯(flometoquin)、扶吉胺(fluzinam)、護汰寧(fludioxonil)、氟菌蟎酯(flufenoxystrobin)、氟嗎啉(flumorph)、氟比來(fluopicolide)、氟派瑞(flupyram)、氟啞菌酯(fluxastrobin)、氟喹唑(flquinconazole)、護矽得(flusilazole)、氟硫滅(flusulfamide)、氟噻菌淨(flutianil)、福多寧(flutolanil)、護汰芬(flutriafol)、氟克殺(fluxapyroxad)、福爾培(folpet)、熱必斯(fthalide) (亦稱為phthalide)、麥穗寧(fuberidazole)、呋霜靈(furalaxyl)、福拉比(furametypr)、菲克利(hexaconazole)、土菌消(hymexazole)、雙胍辛(guazatine)、依滅列(imazalil)、易胺座(imibenconazole)、雙胍辛烷基苯磺酸鹽(iminoctadine albesilate)、雙胍辛三醋酸鹽(iminoctadine triacetate)、歐滴克(iodicarb)、種菌唑(ipconazole)、異非他米多(isofetamid)、丙基喜樂松(iprobenfos)、依普同(iprodione)、異丙菌胺(iprovalicarb)、亞賜圃(isoprothiolane)、亞派占(isopyrazam)、亞汰尼(isotianil)、嘉賜黴素(kasugamycin)、克收欣(kresoxim-methyl)、鋅錳乃浦

(mancozeb)、曼普胺(mandipropamid)、甲氧基丙烯酸酯類殺菌劑mandestrobin、錳乃浦(maneb)、嘧菌胺(mapanipyrin)、滅普寧(mepronil)、硝苯菌酯(meptyldinocap)、滅達樂(metalaxyl)(包括右滅達樂(metalaxyl-M)/甲霜靈(mefenoxam))、滅特座(metconazole)、滅速克(methasulfocarb)、免得爛(metiram)、苯氧菌胺(metominostrobin)、滅芬農(metrafenone)、邁克尼(myclobutanil)、奈替芬(naftitine)、新阿蘇仁(neo-asozin)(甲烷磺酸鐵)、尼瑞莫(nuarimol)、辛異噻唑酮(octhilinone)、呋醯胺(ofurace)、肱醚菌胺(orysastrobin)、毆殺斯(oxadixyl)、氟噻唑吡乙酮(oxathiapiprolin)、歐索林酸(oxolinic acid)、噁咪唑(oxpoconazole)、氧化萎銹靈(oxycarboxin)、土黴素(oxytetracycline)、平克座(penconazole)、賓克隆(pencycuron)、氟唑菌苯胺(penflufen)、吡噻菌胺(penthiopyrad)、稻瘟酯(perfurazoate)、亞磷酸(phosphorous acid)(包括其鹽類,如福賽得(fosetyl-aluminm))、啞氧菌酯(picoxystrobin)、粉病靈(piperalin)、多抗黴素(polyoxin)、撲殺熱(probenazole)、撲克拉(prochloraz)、撲滅寧(procymidone)、普拔克(propamocarb)、普克利(propiconazole)、甲基鋅乃浦(propineb)、普快淨(proquinazid)、硫菌威(prothiocarb)、丙硫菌唑(prothioconazole)、百克敏(pyraclostrobin)、唑胺菌酯(pyrametostrobin)、唑菌酯(pyraoxystrobin)、白粉松(pyrazophos)、吡菌苯威(pyribencarb)、pyributacarb、比芬諾(pyrifenox)、甲氧苯啞菌(pyriofenone)、perisoxazole、派美尼(pyrimethanil)、比芬諾(pyrifenox)、硝吡咯菌素(pyrronitrin)、百快隆(pyroquilon)、唑啞菌酮(quinconazole)、quinmethionate、快諾芬(quinoxyfen)、五氯硝基苯(quintozene)、矽噻菌胺(silthiofam)、氟唑環菌胺(sedaxane)、矽氟唑(simeconazole)、螺環菌胺(spiroxamine)、鏈黴素(streptomycin)、硫磺(sulfur)、得克利(tebuconazole)、喹啉

類殺菌劑tebufloquin、葉枯猷(teclofthalam)、克枯爛(tecloftalam)、四氯硝基苯(tecnazene)、特比那芬(terbinafine)、四克利(tetraconazole)、腐絕(thiabendazole)、賽氟滅(thifluzamide)、多保淨(thiophanate)、甲基多保淨(thiophanate-methyl)、得恩地(thiram)、噻醯菌胺(tiadinil)、脫克松(tolclofos-methyl)、胺基甲酸酯類殺菌劑tolprocarb、甲基益發靈(tolyfluanid)、三泰芬(triadimefon)、三泰隆(triadimenol)、嘧菌醇(triarimol)、咪唑嗪(triazoxide)、三鹼硫酸銅、氯啞菌酯(triclopyricarb)、三得芬(tridemorph)、三氟敏(trifloxystrobin)、賽福座(triflumizole)、三環唑(trimoprhamide)、三賽唑(tricyclazole)、三氟敏(trifloxystrobin)、賽福寧(triforine)、滅菌唑(triticonazole)、烯效唑(uniconazole)、維利黴素(validamycin)、纈菌胺(valifenalate) (亦稱為valifenal)、免克寧(vinclozolin)、鋅乃浦(zineb)、福美鋅(ziram)、座賽胺(zoxamide), 以及1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮；殺線蟲劑，例如氟派瑞(fluopyram)、賜派滅 Spirotetramat)、硫敵克(thiodicarb)、福賽絕(fosthiazate)、阿巴汀(abamectin)、依普同(iprodione)、氟速芬(fluensulfone)、二甲基二硫化物、殺線蟲劑tioxazafen、1,3-二氯丙烯(1,3-dichloropropene, 1,3-D)、斯美地(metam) (鈉與鉀)、邁隆(dazomet)、氯化苦(chloropicrin)、芬滅松(fenamiphos)、普伏松(ethoprophos)、加奪松(cadusaphos)、托福松(terbufos)、imicyafos、毆殺滅(oxamyl)、加保扶(carbofuran)、殺線蟲劑tioxazafen、堅強芽孢桿菌(*Bacillus firmus*) 以及巴斯德桿菌(*Pasteuria nishizawae*)；殺菌劑，例如鏈黴素(streptomycin)；殺蟎劑，例如三亞蟎(amitraz)、蟎離丹(chinomethionat)、克氯苯(chlorobenzilate)、錫蟎丹(cyhexatin)、大克蟎(dicofol)、得氯蟎(dienochlor)、依殺蟎(etoxazole)、芬殺蟎(fenazaquin)、芬佈賜(fenbutatin oxide)、芬普寧(fenpropathrin)、芬普蟎

(fenpyroximate)、合賽多(hexythiazox)、毆蟎多(propargite)、畢達本(pyridaben)，以及得芬瑞(tebufenpyrad)。

【0350】 於某些情況下，本發明之化合物與其他生物活性（特別是無脊椎害蟲防治）化合物或試劑（即活性成分）的組合可以產生增強的效果。減少環境中釋放的活性成分的量同時確保有效的害蟲防治始終是期望的效果。當在施用率下發生增強的無脊椎害蟲防治以得到農學上令人滿意的無脊椎害蟲控制程度時，這種組合可有利於降低作物生產成本並降低環境負荷。

【0351】 本發明之化合物及其組合物可應用於經遺傳轉化以表現對無脊椎害蟲有毒的蛋白質之植物（例如蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*) δ -內毒素）。這種應用可提供更廣泛的植物保護且有利於抗性管理。本發明的外源施用的無脊椎害蟲防治化合物與表現的毒素蛋白組合可以提供增強的效果。

【0352】 這些農業保護劑(即殺蟲劑、殺真菌劑、殺線蟲劑、殺蟎劑、除草劑，以及生物製劑)的一般參考文獻包括The Pesticide Manual, 第13版, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, 英國, 2003年, 以及The BioPesticide Manual, 第2版, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, 英國, 2001年。

【0353】 藉由將一種或多種本發明之化合物(通常以組合物的形式, 以一生物有效量)施用於害蟲的環境, 包括侵染的農業及/或非農學位置, 到要保護的區域, 或直接在要防治的害蟲上, 以在農學及非農學應用中防治無脊椎動物害蟲。

【0354】 因此, 本發明包含用於在農學及/或非農學應用中防治無脊椎害蟲之方法, 包含使無脊椎害蟲或其環境與一生物有效量的一種或多種本發明之化合物接觸, 或與包含至少一種這樣的化合物的組合物, 或包含至少一種這樣的化

合物以及一生物有效量的至少一種額外的生物活性化合物或藥劑之組合物接觸。合適的組合物的實例包含，本發明之化合物以及一生物有效量的至少一種額外的生物活性化合物或藥劑，包括顆粒組合物，其中該額外的活性化合物存在於與本發明之化合物相同的顆粒上，或與本發明之化合物的顆粒分開的顆粒上。

【0355】 為了與本發明之化合物或組合物接觸以保護田間作物免受無脊椎害蟲的侵害，該化合物或組合物通常在種植前施用於作物的種子，施用於作物植物的葉子（例如葉、莖、花、果實），或施用於作物種植之前或之後的土壤或其他生長培養基。

【0356】 接觸方法的一個具體實施例為通過噴霧。或者，可將包含本發明之化合物的顆粒組合物施用於植物葉子或土壤。透過使植物與包含本發明之化合物的組合物接觸，也可透過植物攝取有效地遞送本發明之化合物，本發明之化合物應用作為一種液體配方的土壤浸透液、一種施用於土壤、育苗箱處理或浸漬移植物的顆粒製劑。值得注意的是，本發明之組合物，其為土壤浸漬液製劑之形式。還值得注意的是，用於防治無脊椎害蟲之方法，包含使無脊椎害蟲或其環境與一生物有效量的本發明之化合物或包含一生物有效量的本發明之化合物的組合物接觸。進一步注意的是，該方法，其中環境為土壤，且該組合物作為土壤浸漬製劑施用於土壤。進一步值得注意的是，本發明之化合物透過局部施用於侵染地點也是有效的。其他接觸方法包括，透過直接施用，以及殘留噴霧劑、空氣噴霧劑、凝膠、種子包覆、微囊化、全身吸收、誘餌、標籤、大丸劑、噴霧劑、熏蒸劑、氣溶膠、粉塵，以及許多其他方法施用本發明之化合物或組合物。接觸方法的一個具體實施例為包含本發明之化合物或組合物的尺寸穩定的肥料顆粒、

棒狀物或片劑。本發明之化合物也可浸漬到製造無脊椎動物防治裝置（例如昆蟲網）的材料中。

【0357】 本發明之化合物可用於處理所有植物、植物的部分，以及種子。植物與種子品種及栽培品種可透過常規繁殖及育種方法或透過基因工程方法獲得。遺傳修飾的植物或種子（轉基因植物或種子）為其中異源基因（轉基因）已穩定整合到植物或種子基因組中的那些。由其在植物基因組中的特定位置定義的轉基因被稱為轉化或轉基因事件。

【0358】 可根據本發明處理的遺傳修飾的植物及種子栽培種包括對一種或多種生物脅迫（例如，線蟲、昆蟲、蟎蟲、真菌等害蟲）或非生物脅迫（乾旱、低溫、土壤鹽度等）具有抗性，或含有其他所需特徵的植物及種子栽培種。植物及種子可以進行遺傳修飾，以顯示出特徵，例如，除草劑耐受性、抗蟲性、改良油特性或耐旱性。

【0359】 以本發明之化合物處理遺傳修飾的植物及種子可以產生超級添加或增強的效果。例如，施用率的降低、活性範圍的擴大、對生物/非生物脅迫的耐受性之增加或增強的儲存穩定性，可能比僅透過應用本發明之化合物對遺傳修飾的植物及種子的簡單加成效應更大。

【0360】 本發明之化合物還可用於種子處理，以保護種子免受無脊椎害蟲之侵害。在本發明內容以及申請專利範圍的上下文中，處理種子係指使種子與一生物有效量的本發明之化合物接觸，通常將其配製為本發明之組合物。該種子處理保護種子免受無脊椎動物土壤害蟲的侵害，且通常還可以保護與發芽種子發育的幼苗土壤接觸的根和其他植物部分。種子處理還可透過本發明之化合物或發育植物中的第二活性成分的轉移來提供對葉子的保護。種子處理可以應用於

所有類型的種子，包括那些遺傳轉化以表現特定性狀的植物將發芽的種子。代表性的例子包括那些表現對無脊椎害蟲有毒的蛋白質，如蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)毒素或表現除草劑抗性的那些，例如草甘膦乙醯轉移酶，其提供對草甘膦的抗性。以本發明之化合物進行種子處理也可以增加從種子生長的植物的活力。

【0361】 種子處理的一種方法為在播種種子之前以本發明之化合物(即作為配製的組合物)噴灑或撒粉種子。配製用於種子處理的組合物通常包含成膜劑或黏合劑。因此，通常本發明的種子包覆組合物包含一生物有效量的式1之化合物，以及成膜劑或黏合劑。可透過將可流動的懸浮濃縮物直接噴灑到種子翻滾床中然後乾燥種子來塗覆種子。或者，可以將其他製劑類型，如濕潤粉末、溶液、懸乳劑、可乳化濃縮物，以及水中的乳液噴灑在種子上。該方法對於在種子上施加薄膜包覆特別有用。本領域技術人員可獲得各種塗佈機及方法。合適的方法包括P. Kusters等人，*Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994年 BCPC Mongraph No. 57，以及其中列出的參考文獻。

【0362】 單獨以及與其它殺蟲劑、殺線蟲劑，以及殺真菌劑組合的式1之化合物及其組合物特別適用於作物的種子處理，包括，但不限於，玉蜀黍或玉米、大豆、棉花、穀物（例如，小麥、燕麥、大麥、黑麥以及稻米）、馬鈴薯、蔬菜，以及油菜。

【0363】 可與式1之化合物一起配製以提供用於種子處理的混合物的其它殺蟲劑包括阿巴汀(abamectin)、亞滅培(acetamiprid)、阿納寧(acrinathrin)、三亞蟎(amitraz)、阿維菌素(avermectin)、印棟素(azadirachtin)、免速達(bensultap)、畢芬寧(bifenthrin)、布芬淨(buprofezin)、硫線磷(cadusafos)、加保利(carbaryl)、加保扶

(carbofuran)、培丹(cartap)、剋安勃(chlorantraniliprole)、克凡派(chlorfenapyr)、陶斯松(chlorpyrifos)、可尼丁(clothianidin)、賽安勃(cyantraniliprole)、賽扶寧(cyfluthrin)、貝他賽扶寧(beta-cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、伽瑪賽洛寧(gamma-cyhalothrin)、高效賽洛寧(lambda-cyhalothrin)、賽滅寧(cypermethrin)、亞滅寧(alpha-cypermethrin)、傑他賽滅寧(zeta-cypermethrin)、賽滅淨(cyromazine)、第滅寧(deltamethrin)、地特靈(dieldrin)、達特南(dinotefuran)、茂醚(diofenolan)、因滅汀(emamectin)、安殺番(endosulfan)、益化利(esfenvalerate)、益斯普(ethiprole)、依芬寧(etofenprox)、依殺蟎(etoxazole)、芬硫克(fenothiocarb)、芬諾克(fenoxycarb)、芬化利(fenvalerate)、芬普尼(fipronil)、氟尼胺(flonicamid)、氟大滅(flubendiamide)、氟芬隆(flufenoxuron)、福化利(flualinate)、覆滅蟎(formetanate)、福賽絕(fosthiazate)、六伏隆(hexaflumuron)、愛美松(hydramethylnon)、益達胺(imidacloprid)、因得克(indoxacarb)、祿芬隆(lufenuron)、美氟綜(metaflumizone)、滅賜克(methiocarb)、納乃得(methomyl)、美賜平(methoprene)、滅芬諾(methoxyfenozide)、烯啞蟲胺(nitenpyram)、硝蟲噻嗪(nithiazine)、諾伐隆(novaluron)、毆殺滅(oxamyl)、派滅淨(pymetrozine)、除蟲菊精(pyrethrin)、畢達本(pyridaben)、三氟甲吡醚(pyridalyl)、百利普芬(pyriproxyfen)、魚尼丁(ryanodine)、賜諾特(spinetoram)、多殺菌素(spinosad)、賜派芬(spirodiclofen)、賜滅芬(spiromesifen)、賜派滅(spirotetramat)、速殺氟(sulfoxaflor)、得芬諾(tebufenozide)、治滅寧(tetramethrin)、賽果培(thiacloprid)、賽速安(thiamethoxam)、硫敵克(thiodicarb)、殺蟲雙(thiosultap-sodium)、泰滅寧(tralomethrin)、啞蚜威(triazamate)、殺蟲隆(triflumuron)、蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*) δ -內毒素、蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)的所有菌株，以及所有核多角體病毒株。

【0364】 可以與式1之化合物一起配製以提供用於種子處理的混合物的殺真菌劑包括安美速(amisulbrom)、亞托敏(azoxystrobin)、白克列(boscalid)、鋅錳乃浦(carbendazim)、萎銹靈(carboxin)、克絕(cymoxanil)、環克座(cyproconazole)、待克利(difenoconazole)、達滅芬(dimethomorph)、扶吉胺(fluzinam)、護汰寧(fludioxonil)、氟喹唑(flquinconazole)、氟比來(flupicolide)、氟嘧菌酯(fluxastrobin)、護汰芬(flutriafol)、氟克殺(fluxapyroxad)、種菌唑(ipconazole)、依普同(iprodione)、滅達樂(metalaxyl)、甲霜靈(mefenoxam)、滅特座(metconazole)、邁克尼(myclobutanil)、巴克素(paclobutrazole)、氟唑菌苯胺(penflufen)、啞氧菌酯(picoxystrobin)、丙硫菌唑(prothioconazole)、百克敏(pyraclostrobin)、氟唑環菌胺(sedaxane)、矽噻菌胺(silthiofam)、得克利(tebuconazole)、腐絕(thiabendazole)、甲基多保淨(thiophanate-methyl)、得恩地(thiram)、三氟敏(trifloxystrobin), 以及滅菌唑(triticonazole)。

【0365】 包含可用於種子處理的式1之化合物的組合物可進一步包含能夠提供保護免受植物病原真菌或細菌及/或土壤出生動物，如線蟲，的有害作用的細菌及真菌。表現出殺線蟲特性的細菌可包括，但不限於，堅強芽孢桿菌(*Bacillus firmus*)、蠟狀芽孢桿菌(*Bacillus cereus*)、枯草芽孢桿菌(*Bacillus subtilis*)，以及巴氏桿菌(*Pasteuria penitans*)。合適的堅強芽孢桿菌(*Bacillus firmus*)菌株為菌株 CNCMI-1582 (GB-126)，其以BioNem™市售可得。合適的蠟狀芽孢桿菌(*Bacillus cereus*)菌株為菌株 NCMM I-1592。兩種芽孢桿菌菌株均公開於美國專利號US 6,406,690中。具有殺線蟲活性的其他合適的細菌為解澱粉芽孢桿菌(*B. amyloliquefaciens*) IN937a以及枯草芽孢桿菌(*B. subtilis*)菌株GB03。具有殺真菌特性的細菌可包括，但不限於，短小芽孢桿菌(*B. pumilus*)菌株GB34。表現出殺線

蟲特性的真菌物種可包括，但不限於，疣孢漆斑菌(*Myrothecium verrucaria*)、淡紫擬青黴(*Paecilomyces lilacinus*)，以及淡紫紫黴(*Purpureocillium lilacinum*)。

【0366】種子處理還可包括一種或多種天然來源的殺線蟲劑，例如稱為 harpin 的激發子蛋白，其從某些細菌植物病原體如解澱粉歐文氏菌(*Erwinia amylovora*)中分離。一個實例為 Harpin-N-Tek 種子處理技術，其以 N-Hibit™ Gold CST 市售可得。

【0367】種子處理還可以包括一種或多種豆科植物根瘤結瘤細菌，例如微生物固氮細菌 *Bradyrhizobium japonicum*。這些接種物可任選地包括一種或多種脂殼寡糖 (lipo-chitooligosaccharides, LCO)，其為在豆科植物根部形成結節期間由根瘤菌產生的結瘤(Nod)因子。例如，Optimize® 品牌種子處理技術將 LCO Promoter Technology™ 與接種劑結合使用。

【0368】種子處理還可以包括一種或多種異黃酮，其可以增加菌根真菌的根定殖程度。菌根真菌透過增加水、硫酸鹽、硝酸鹽、磷酸鹽，以及金屬等營養素的根吸收來改善植物生長。異黃酮的實例包括，但不限於，染料木黃酮、生物素A、芒柄花素、大豆昔元、黃豆黃素、橙皮素、柚皮素，以及紅車軸草素。芒柄花素可作為菌根接種劑產品的有效成分，如，PHC Colombize® AG。

【0369】種子處理還可以包括一種或多種植物活化劑，其在病原體接觸後誘導植物中的系統獲得性抗性。誘導這種保護機制的植物活化劑的實例為噻二唑素S-甲基(acibenzolar-S-methyl)。

【0370】經處理的種子通常包含每100 kg種子約0.1 g至1 kg的本發明之化合物(即，處理前種子重量的約0.0001至1%)。配製用於種子處理的可流動懸浮液通常包含約0.5至約70%的活性成分，約0.5%至約30%的成膜黏合劑，約0.5至

約20%的分散劑，0至約5%的增稠劑，0至約5%的顏料及/或染料，0至約2%的消泡劑，0至約1%的防腐劑，以及0至約75%的揮發性液體稀釋劑。

【0371】 本發明之化合物可摻入誘餌組合物中，該誘餌組合物被無脊椎害蟲消耗或用於例如，誘捕器、誘餌站等裝置中。這種誘餌組合物可為顆粒形式，其包含(a)活性成分，即一生物有效量的式1之化合物；(b)一種或多種食物原料；任選地(c)引誘劑，以及任選地(d)一種或多種保濕劑。值得注意的是，顆粒或誘餌組合物，其包含約0.001-5%的活性成分，約40-99%的食物材料及/或引誘劑；以及任選約0.05-10%的保濕劑，它們以非常低的施用率有效地防治土壤無脊椎害蟲，特別是在透過攝取而不是通過直接接觸致死的活性成分劑量下。一些食物材料既可以作為食物來源也可以作為引誘劑。食物材料包括碳水化合物、蛋白質，以及脂質。食材的實例為蔬菜粉、糖、澱粉、動物脂肪、植物油、酵母萃取物，以及乳固體。引誘劑的實例為氣味劑與調味劑，例如水果或植物萃取物、香水，或其他動物或植物成分、已知吸收目標無脊椎害蟲的信息素或其他試劑。保濕劑，即濕度維持劑，的實例為二醇和其他多元醇、甘油，以及山梨糖醇。值得注意的是，用於防治至少一種選自由螞蟻、白蟻，以及蟑螂所組成之群組的無脊椎害蟲的誘餌組合物(以及利用這種誘餌組合物之方法)。用於防治無脊椎害蟲的裝置可包含本發明的誘餌組合物以及適於接收誘餌組合物的殼體，其中該殼體具有至少一個開口，該開口的尺寸允許該無脊椎害蟲通過該開口，使得該無脊椎害蟲可以從該殼体外部的位罝接近該誘餌組合物，且其中該殼體還適於放置在無脊椎害蟲的潛在或已知活動的場所中或附近。

【0372】 本發明之一個具體實施例涉及防治無脊椎害蟲之方法，包含以水稀釋本發明之殺蟲組合物(以界面活性劑、固體稀釋劑以及液體稀釋劑配製的式

1之化合物或式1之化合物與至少一種其它的殺蟲劑的配製混合物)，並任選加入佐劑以形成稀釋的組合物，並使無脊椎害蟲或其環境與一有效量的該稀釋的組合物接觸。

【0373】 儘管透過以水稀釋足夠濃度的本發明殺蟲組合物形成的噴霧組合物可提供足夠的防治無脊椎害蟲的功效，但也可將單獨配製的佐劑產品加入到噴霧罐混合物中。這些額外的佐劑通常稱為「噴霧輔助劑」或「罐混助劑」，且包括在噴霧罐中混合的任何物質，以改善殺蟲劑的性能或改變噴霧混合物的物理性質。佐劑可為界面活性劑、乳化劑、石油基作物油、作物衍生的種子油、酸化劑、緩衝劑、增稠劑，或消泡劑。佐劑用於增強功效（例如，生物利用度、黏附性、滲透性、覆蓋均勻性，以及保護耐久性），或最小化或消除與不相容性、發泡、漂移、蒸發、揮發，以及降解相關的噴霧應用問題。為了獲得最佳性能，根據活性成分、製劑，以及目標（例如作物、害蟲）的性質選擇佐劑。

【0374】 在噴霧助劑中，包括作物油、作物油濃縮物、植物油濃縮物，以及甲基化種子油濃縮物的油最常用於改善殺蟲劑的功效，可能透過促進更均勻且一致的噴霧沉積物。在可能由油或其它與水不混溶的液體引起的植物毒性受到關注的情況下，由本發明之組合物製備的噴霧組合物通常不含油基噴霧助劑。然而，在由油基噴霧助劑引起的植物毒性在商業上不顯著的情況下，由本發明組合物的組合物製備的噴霧組合物也可含有油基噴霧助劑，這可能會進一步增加對無脊椎害蟲的防治，以及耐雨性。

【0375】 被鑑定為「作物油」的產品通常含有95至98%的石蠟或石腦油基石油以及1至2%的一種或多種作為乳化劑的界面活性劑。被確定為「作物油濃縮物」的產品通常由80至85%的可乳化石油基油以及15至20%的非離子界面活性劑

組成。正確鑑定為「植物油濃縮物」的產品通常由80至85%的植物油(即種子或果油，最常見地來自棉花、亞麻籽、大豆或向日葵)以及15至20%的非離子界面活性劑組成。透過用通常衍生自植物油的脂肪酸甲酯代替植物油可以改善佐劑性能。甲基化種子油濃縮物的實例包括MSO[®]濃縮液(UAP-Loveland Products公司)以及優質MSO甲基化噴霧油(Helena化學公司)。

【0376】 添加到噴霧混合物中的佐劑的量通常不超過約2.5% (體積)，更通常的量為約0.1至約1% (體積)。添加到噴霧混合物中的佐劑的施用率通常為每公頃約1至5L。噴霧助劑的代表性實例包括：溶於液態烴的Adigor[®] (先正達公司) 47%甲基化菜籽油、Silwet[®] (Helena化學公司)聚環氧烷改質的七甲基三矽氧烷，以及Assist[®] (BASF公司)於83%石蠟基礦物油中的17%界面活性劑摻合物。

【0377】 本發明之化合物可以在沒有其他佐劑的情況下施用，但最常應用的是包含一種或多種活性成分以及合適的載體、稀釋劑，以及界面活性劑的製劑，並且可能根據預期的最終用途與食物組合。一種施用方法包括噴灑本發明之化合物的水分散體或精製油溶液。與噴霧油、噴霧油濃度、塗佈劑貼劑、佐劑、其他溶劑，以及胡椒基丁醚的組合通常可提高化合物功效。對於非農學用途，這種噴霧劑可透過幫浦或透過從加壓容器（例如，加壓氣溶膠噴霧罐）中釋放而從噴霧容器如，罐、瓶或其它容器施加。這種噴霧組合物可以採用各種形式，例如噴霧、霧、泡沫、煙霧或霧。因此，這種噴霧組合物可以根據具體情況進一步包含推進劑、發泡劑等。值得注意的是，噴霧組合物，其包含一生物有效量的本發明之化合物或組合物以及載體。這種噴霧組合物的一個具體實施例包含一生物有效量的本發明之化合物或組合物以及推進劑。代表性推進劑包括，但不限於，甲烷、乙烷、丙烷、丁烷、異丁烷、丁烯、戊烷、異戊烷、新戊烷、戊烯、氫氟

碳化合物、氯氟烴、二甲醚，以及前述之混合物。值得注意的是，用於控制至少一種選自由蚊子、黑蠅、驅避蒼蠅、鹿蠅、馬蠅、黃蜂、胡蜂、黃蜂、蜉、蜘蛛、螞蟻、蝨子等所組成之群組，包括單獨或組合的無脊椎害蟲的噴霧組合物（以及利用從噴霧容器分配的這種噴霧組合物之方法）。

【0378】 以下試驗證明了本發明之化合物對特定害蟲的防治效力。「防治效力」表示抑制無脊椎害蟲的發展（包括死亡率），導致餵食顯著減少。然而，化合物提供的害蟲防治保護不限於這些物種。有關化合物描述，請參見索引表A-G。

本發明之生物學實施例

測試A-H之配方及噴霧方法

【0379】 使用含有10%丙酮、90%水，以及300 ppm Activator 90®非離子界面活性劑的溶液 (Loveland Products, Loveland, 科羅拉多州, 美國) 配製測試化合物。將配製的化合物透過位於每個測試單元頂部上方1.27 cm (0.5英寸)的霧化器噴嘴施加在1 mL液體中。以指定的速率噴灑測試化合物，並將每個測試重複三次。

測試A

【0380】 為了評估小菜蛾(*Plutella xylostella* (L.))的防治，測試單元由內部具有12-14天齡芥菜植物的小開口容器組成。其以約50隻新生幼蟲預先侵染，這些幼蟲使用接種器透過玉米穗粒子分配到測試單元中。在分配到測試單元後，幼蟲移動到測試植物上。

【0381】 配製測試化合物並以250、50、10，以及2 ppm噴霧。在噴灑配製的測試化合物後，使每個測試單元乾燥1小時，然後將黑色的篩過的蓋子置於頂

部。將測試單元於25°C以及70%相對濕度的生長室中保持6天。然後根據消耗的葉子目測評估植物飼養損傷，並評估幼蟲的死亡率。

【0382】 在250 ppm下測試的式1之化合物中，以下提供了非常好的至優異的對照效力程度（40%或更低的攝食損傷及/或100%死亡率）：1、2、10、34、35、39，以及40。

【0383】 在以50 ppm測試的式1之化合物中，以下提供了非常好的至優異的對照效力程度（40%或更低的攝食損傷及/或100%死亡率）：1、2、10、34、35、39，以及40。

【0384】 在以10 ppm測試的式1之化合物中，以下提供了非常好的至優異的對照效力程度（40%或更低的攝食損傷及/或100%死亡率）：1、2、3、4、5、6、7、8、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、34、35、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、63、65、70、71、72、73、74、75、76、77、78，以及79。

【0385】 在以2 ppm測試的式1之化合物中，以下提供了非常好的至優異的對照效力程度（40%或更低的攝食損傷及/或100%死亡率）：1、2、3、4、5、6、7、8、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、22、23、24、26、27、28、29、30、31、33、34、35、39、40、41、43、44、45、46、47、48、49、50、52、53、55、56、58、59、60、61、63、65、70、71、72、73、74、75、76、77、78，以及79。

測試B

【0386】 為了評估秋行軍蟲(*Spodoptera frugiperda* (J.E.Smith))的防治，測試單元由一個小的開口容器組成，裡面有一個4-5天的玉米(玉蜀黍)植物。其在一片昆蟲飼料中以10-15隻1日齡幼蟲預先侵染。

【0387】 配製測試化合物並以250、50、10，以及2 ppm噴霧。在噴灑配製的測試化合物後，將測試單元在25°C以及70%相對濕度下在生長室中保持6天。然後根據消耗的葉子目測評估植物飼養損傷，並評估幼蟲的死亡率。

【0388】 在250 ppm下測試的式1之化合物中，以下提供了非常好的至優異的對照效力程度（40%或更低的攝食損傷及/或100%死亡率）：1、2、10、34、35、39，以及40。

【0389】 在以50 ppm測試的式1之化合物中，以下提供了非常好的至優異的對照效力程度（40%或更低的攝食損傷及/或100%死亡率）：1、2、10、34、35、39，以及40。

【0390】 在以10 ppm測試的式1之化合物中，以下提供了非常好的至優異的對照效力程度（40%或更低的攝食損傷及/或100%死亡率）：1、2、3、4、6、7、8、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、22、23、24、27、28、29、30、31、33、34、39、41、43、44、45、46、47、48、49、50、52、55、58、59、60、61、63、65、70、71、72、73、74、75、76、77、78，或79。

【0391】 在以2 ppm測試的式1之化合物中，以下提供了非常好的至優異的對照效力程度（40%或更少的餵養傷害及/或100%的死亡率）：1、2、3、4、8、10、11、13、15、16、18、19、20、33、34、39、43、46、49、50、59、60、61、63、65、70、71、74、76、78，或79。

測試C

第 123 頁，共 128 頁(發明說明書)

【0392】 為了透過接觸及/或系統方法評估玉米飛蟲(*Peregrinus maidis* (Ashmead))的防治，測試單元由一個小的開口容器組成，裡面有一個3-4天大的玉米（玉蜀黍）植物。在施用測試化合物之前，將白砂添加到土壤的頂部。

【0393】 配製測試化合物並以50 ppm噴霧。在噴灑配製的測試化合物後，使測試單元乾燥1小時，然後以約15-20隻稚蟲（18至21日齡）進行後感染。將黑色篩網帽置於每個測試單元的頂部，並將測試單元在22-24°C以及50-70%相對濕度的生長室中保持6天。然後目測評估每個測試單元的昆蟲死亡率。

【0394】 在50 ppm下測試的式1之化合物中，以下導致至少80%的死亡率：
11、44、46、60、61，以及63。

測試D

【0395】 為了透過接觸及/或系統方式評估馬鈴薯葉蟬(*Empoasca fabae* (Harris))的防治，測試單元由一個小的開口容器組成，裡面有一個5-6天大的Soleil豆植物(出現初生葉)。將白砂加入土壤頂部，並在施用試驗化合物之前切下一片初生葉。

【0396】 配製測試化合物並以250、50、10，以及2 ppm噴霧。噴灑配製的試驗化合物後，讓試驗單位乾燥1小時，然後以5隻馬鈴薯葉蟬（18至21日齡成蟲）進行後侵染。將黑色篩網帽置於測試單元的頂部，並將測試單元在20°C以及70%相對濕度的生長室中保持6天。然後目測評估每個測試單元的昆蟲死亡率。

【0397】 在250 ppm下測試的式1之化合物中，以下導致至少80%的死亡率：
1、2、10、34、35、39，以及40。

【0398】 在50 ppm下測試的式1之化合物中，以下導致至少80%的死亡率：
1、2、3、4、5、8、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、27、31、

33、34、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、52、53、55、58、59、60、61、63、65、70、71、72、75、76、78，或79。

【0399】 在以10 ppm測試的式1之化合物中，以下導致至少80%的死亡率：
3、4、8、10、11、13、14、15、16、18、19、20、27、33、41、43、44、47、48、49、50、52、58、59、60、61、63、65、70、71、72、75、76、78、79。

【0400】 在以2 ppm測試的式1之化合物中，以下導致至少80%的死亡率：
15、16、18、20、33、61，以及63。

測試E

【0401】 為了透過接觸及/或系統方法評估對綠桃蚜（*Myzus persicae* (Sulzer)）的防治，測試單元由一個小的開口容器組成，裡面有12-15天的蘿蔔植物。透過在從培養植物切下的一片葉子上放置30-40隻蚜蟲的葉子上進行預侵染（切葉法）。當葉片乾燥時，蚜蟲移動到試驗植物上。在預感染之後，測試單元的土壤覆蓋有一層沙子。

【0402】 配製測試化合物並以250、50，以及10 ppm噴霧。在噴灑配製的測試化合物後，使每個測試單元乾燥1小時，然後將黑色的篩過的蓋子置於頂部。將測試單元在19-21°C以及50-70%相對濕度的生長室中保持6天。然後目測評估每個測試單元的昆蟲死亡率。

【0403】 在250 ppm下測試的式1之化合物中，以下導致至少80%的死亡率：
2、10、34，以及35。

【0404】 在50 ppm下測試的式1之化合物中，以下導致至少80%的死亡率：
3、4、8、11、18、19、20、33、34、35、41、44、50、58、60、61、63，以及70。

【0405】 在10 ppm下測試的式1之化合物中，以下導致至少80%的死亡率：
61以及63。

測試F

【0406】 為了透過接觸及/或系統方法評估棉蚜（*Aphis gossypii* (Glover)）的防治，測試單元由一個小的開口容器組成，裡面有一個5天大的秋葵植物。根據切葉法，在一片葉子上預先感染30-40隻昆蟲，並以一層沙子覆蓋測試單元的土壤。

【0407】 配製測試化合物並以250、50，以及10 ppm噴霧。噴霧後，將測試單元在19°C以及70%相對濕度下在生長室中保持6天。然後目測評估每個測試單元的昆蟲死亡率。

【0408】 在250 ppm下測試的式1之化合物中，以下導致至少80%的死亡率：
1、2、10、34、35，以及39。

【0409】 在50 ppm下測試的式1之化合物中，以下導致至少80%的死亡率：
3、4、8、10、11、16、18、19、20、22、33、34、35、41、44、46、47、49、
50、55、58、59、60、61、63，以及70。

【0410】 在以10 ppm測試的式1之化合物中，以下導致至少80%的死亡率：
19、20、33、41、44、59、60、61、63，以及70。

測試G

【0411】 為了透過接觸及/或系統方式評估甘藷粉蝨（*Bemisia tabaci* (Gennadius)）的防治，測試單元由小的開口容器組成，裡面有12-14天的棉花植物。在噴灑施用之前，從植物中取出兩個子葉，留下一片真葉用於測定。允許成

年粉蝨在植物上產卵，然後從測試單元中取出。用至少15個卵侵染的棉花植物進行試驗以進行噴霧。

【0412】 配製測試化合物並以250、50，以及10 ppm噴霧。噴霧後，使測試單元乾燥1小時。然後取出圓筒，將單元放入生長室並在28°C以及50-70%相對濕度下保持13天。然後目測評估每個測試單元的昆蟲死亡率。

【0413】 在250 ppm下測試的式1之化合物中，以下導致至少70%的死亡率：2、34，以及40。

【0414】 在50 ppm下測試的式1之化合物中，以下導致至少70%的死亡率：3、8、11、15、17、18、19、20、33、34、41、42、44、46、49、55、58、60、61、63，以及70。

【0415】 在10 ppm下測試的式1之化合物中，以下導致至少70%的死亡率：8、11、18、19、20、33、34、42、49、61，以及63。

【0416】 在以2 ppm測試的式1之化合物中，以下導致至少70%的死亡率：18、20、33，以及63。

測試H

【0417】 為了通過接觸及/或系統方法評估西部花薊馬（*Frankliniella occidentalis* (Pergande)）的防治，測試單元由一個小的開口容器組成，裡面有一個5-7天齡的Soleil豆植物。

【0418】 配製測試化合物並以250、50、10，以及2 ppm噴霧。噴霧後，使試驗單元乾燥1小時，然後向每個單元中加入約60隻薊馬（成蟲以及幼蟲）。將黑色篩網蓋置於頂部，並將測試單元在25°C以及45-55%相對濕度下保持6天。然後目測評估每個測試單元的植物損傷和昆蟲死亡率。

【0419】 在250 ppm下測試的式1之化合物中，以下提供了非常好的至優異的對照效力程度（30%或更少的植物損害及/或100%的死亡率）：1、2、10、34、35、39，以及40。

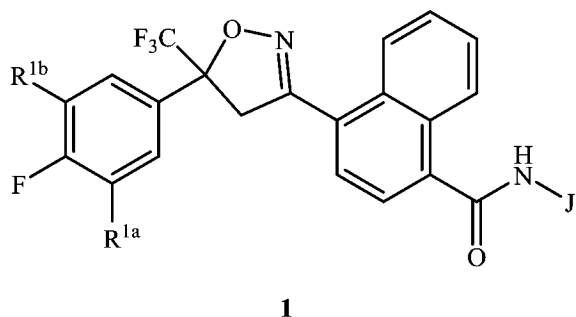
【0420】 在50 ppm下測試的式1之化合物中，以下提供了非常好的至優異的對照效力程度（30%或更少的植物損害及/或100%的死亡率）：1、10、34、35、39，以及40。

【0421】 在以10 ppm測試的式1之化合物中，以下提供了非常好的至優異的對照效力程度（30%或更少的植物損害及/或100%的死亡率）：1、3、4、5、7、8、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、25、26、27、28、29、31、33、34、39、41、43、44、45、46、47、48、49、50、58、59、60、61、63、65、70、71、72、73、74、75、76、78，以及79。

【0422】 在以2 ppm測試的式1之化合物中，以下提供了非常好的至優異的對照效力程度（30%或更少的植物損害及/或100%的死亡率）：3、4、8、10、11、13、14、16、19、20、22、26、27、33、34、39、43、44、46、47、50、59、60、61、63、70、71、72、73、74、75、76、78，以及79。

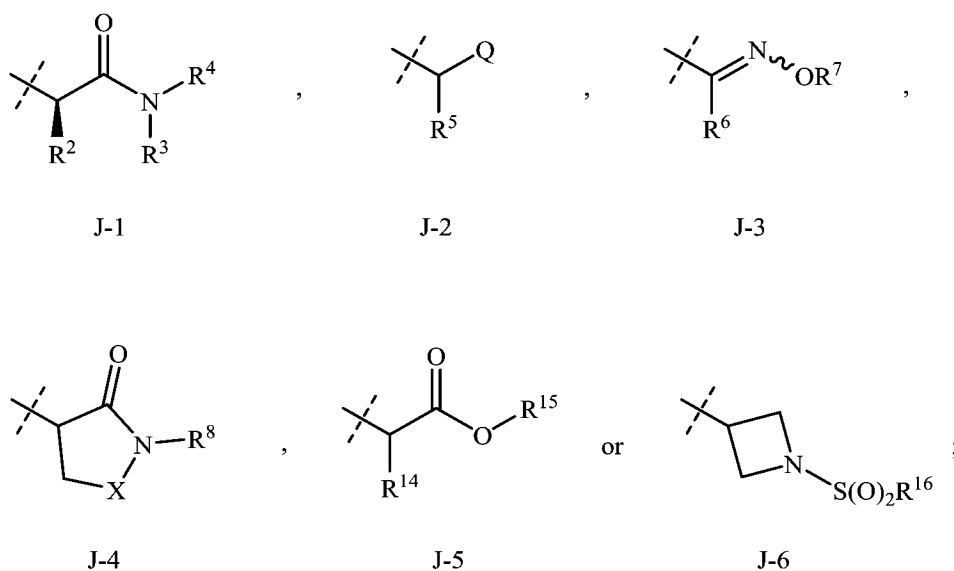
【英文】

Disclosed are compounds of Formula 1,



wherein

J is



and R^{1a} , R^{1b} , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^{14} , R^{15} , R^{16} , Q and X are as defined in the disclosure. Also disclosed are compositions containing the compounds of Formula 1 and methods for controlling an invertebrate pest comprising contacting the invertebrate pest or its environment with a biologically effective amount of a compound or a composition of the invention.

- R^3 為 H；或 C_1-C_4 烷基，未被取代或以獨立地選自氰基、硝基、 OR^9 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 CO_2R^{11} 以及 $C(O)NR^{12}R^{13}$ 的取代基取代；
- R^4 為 H、 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 鹵代烷基；
- R^5 為 H 或 C_1-C_4 烷基；
- R^6 為 H 或 C_1-C_4 烷基；
- R^7 為 H、 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 鹵代烷基；
- X 為 -O- 或 -C(O)-；
- R^8 為 H、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵代烷基或 C_3-C_6 環烷基；
- 每個 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 以及 R^{13} 獨立地為 H 或 C_1-C_4 烷基；
- R^{14} 為 H；或 C_1-C_4 烷基，未被取代或以獨立地選自氰基、硝基、 OR^9 、 $S(O)_nR^{10}$ 、 CO_2R^{11} 以及 $C(O)NR^{12}R^{13}$ 的取代基取代；
- R^{15} 為 H、 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 鹵代烷基；
- R^{16} 為氟、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵代烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵代烷氧基、胺基或 C_1-C_6 烷基胺基；
- R^{17} 為 H、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵代烷基或 C_3-C_6 環烷基；
- Q 為吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、噻嗪基、1,2,4-三嗪基、1,3,5-三嗪基、呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、1,2,3-三唑基、1,2,4-三唑基、四唑基、噁唑基、噻唑基、異噁唑基、異噻唑基、1,2,3-噁二唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基或 1,3,4-噻二唑基，每個未被取代或以獨立地選自氰基、硝基、鹵素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 鹵代烷硫基、 C_1-C_4 烷基亞磺醯基、 C_1-C_4 鹵代烷基亞磺醯基、 C_1-C_4

烷基磺醯基、 C_1-C_4 鹵代烷基磺醯基、 C_2-C_5 烷氧基羰基、 C_2-C_5 烷基胺基羰基以及 C_3-C_5 二烷基胺基羰基的取代基取代；以及

每個 n 獨立地為 0、1 或 2。

【第2項】如申請專利範圍第1項之化合物，其中J為以一個氰基取代的 C_2-C_4 烷基；以一個氰基取代的 $-CH_2$ （環丙基）；或未被取代的或以一個氰基或一個 $C(O)NHR^{17}$ 取代的環丙基；或J-1、J-2或J-5。

【第3項】如申請專利範圍第2項之化合物，其中

R^{1a} 為Cl且 R^{1b} 為Cl；或

R^{1a} 為 CF_3 且 R^{1b} 為H。

【第4項】如申請專利範圍第3項之化合物，其中

J為以一個氰基取代的 C_2-C_4 烷基；或環丙基。

【第5項】如申請專利範圍第3項之化合物，其中J為J-1。

【第6項】如申請專利範圍第5項之化合物，其中

R^2 為甲基；

R^3 為H或甲基；以及

R^4 為H或甲基。

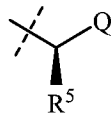
【第7項】如申請專利範圍第3項之化合物，其中J為J-2。

【第8項】如申請專利範圍第7項之化合物，其中

R^5 為H或甲基；以及

Q為吡啶基或嘧啶基。

【第9項】如申請專利範圍第8項之化合物，其中J-2為



J-2a。

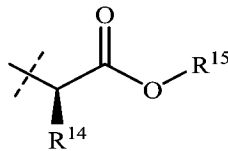
【第10項】如申請專利範圍第3項之化合物，其中J為J-5。

【第11項】如申請專利範圍第10項之化合物，其中

R^{14} 為H或甲基；以及

R^{15} 為 C_1 - C_4 烷基。

【第12項】如申請專利範圍第11項之化合物，其中J-5為



J-5a。

【第13項】一種組合物，包含如申請專利範圍第1項之化合物以及至少一種額外的組成分，該組成分係選自由界面活性劑、固體稀釋劑，以及液體稀釋劑所組成之群組，該組合物任選地還包含至少一種額外的生物活性化合物或試劑。

【第14項】如申請專利範圍第13項之組合物，其中該至少一種額外的生物活性化合物或試劑係選自由下列所組成之群組：阿巴汀(abamectin)、歐殺松(acephate)、亞醜蟎(acequinocyl)、亞滅培(acetamiprid)、阿納寧(acrinathrin)、雙丙環蟲酯(afidopyropen)、磺胺蟎酯(amidoflumet)、三亞蟎(amitraz)、阿維菌素(avermectin)、印棟素(azadirachtin)、谷速松(azinphos-methyl)、免扶克(benfuracarb)、免速達(bensultap)、畢芬寧(bifenthrin)、必芬蟎(bifenazate)、雙三氟蟲脲(bistrifluron)、硼酸(borate)、布芬淨(buprofezin)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、培丹(cartap)、伐蟲脛(carzol)、剋安勃(chlorantraniliprole)、克凡派(chlorfenapyr)、克福隆(chlorfluazuron)、陶斯松(chlorpyrifos)、甲基陶斯松

(chlorpyrifos-methyl)、可芬諾(chromafenozide)、克芬(clofentezin)、可尼丁(clothianidin)、賽安勃(cyantraniliprole)、環溴蟲醯胺(cyclaniliprole)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、環氧蟲啉(cycloxaprid)、賽芬蟎(cyflumetofen)、賽扶寧(cyfluthrin)、貝他賽扶寧(beta-cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、伽瑪賽洛寧(gamma-cyhalothrin)、高效賽洛寧(lambda-cyhalothrin)、賽滅寧(cypermethrin)、亞滅寧(alpha-cypermethrin)、傑他賽滅寧(zeta-cypermethrin)、賽滅淨(cyromazine)、第滅寧(deltamethrin)、汰芬隆(diafenthiuron)、大利松(diazinon)、地特靈(dieldrin)、二福隆(diflubenzuron)、四氟甲醚菊酯(dimefluthrin)、殺蟲雙(dimehypo)、大滅松(dimethoate)、達特南(dinotefuran)、茂醚(diofenolan)、因滅汀(emamectin)、安殺番(endosulfan)、益化利(esfenvalerate)、益斯普(ethiprole)、依芬寧(etofenprox)、依殺蟎(etoxazole)、芬佈賜(fenbutatin oxide)、撲滅松(fenitrothion)、芬硫克(fenothiocarb)、芬諾克(fenoxycarb)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、芬普尼(fipronil)、氟麥托醯(flometoquin)、氟尼胺(flonicamid)、氟大滅(flubendiamide)、護賽寧(flucythrinate)、嘧蟲胺(flufenerim)、氟芬隆(flufenoxuron)、氟菌蟎酯(flufenoxystrobin)、氟速芬(flufensulfone)、氟派瑞(fluorpyram)、丁烯氟蟲腈(flufiprole)、氟吡呋喃酮(flupyradifurone)、福化利(flualinate)、淘福化利(tau-fluvalinate)、大福松(fonophos)、覆滅蟎(formetanate)、福賽絕(fosthiazate)、合芬隆(halofenozide)、擬除蟲菊酯類殺蟲劑heptafluthrin、六伏隆(hexaflumuron)、合賽多(hexythiazox)、愛美松(hydramethylnon)、益達胺(imidacloprid)、因得克(indoxacarb)、殺蟲皂(insecticidal soaps)、亞芬松(isofenphos)、祿芬隆(lufenuron)、馬拉松(malathion)、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、美氟綜(metaflumizone)、聚乙醛(metaldehyde)、達馬松(methamidophos)、滅大松(methidathion)、滅蟲威

(methiodicarb)、納乃得(methomyl)、美賜平(methoprene)、甲氧DDT(methoxychlor)、美特寧(metofluthrin)、亞素靈(monocrotophos)、美特寧(monofluthrin)、滅芬諾(methoxyfenozide)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、硝蟲噻嗪(nithiazine)、諾伐隆(novaluron)、諾福隆(noviflumuron)、毆殺滅(oxamyl)、巴拉松(parathion)、甲基巴拉松(parathion-methyl)、百滅寧(permethrin)、福瑞松(phorate)、裕必松(phosalone)、益滅松(phosmet)、福賜米松(phosphamidon)、比加普(pirimicarb)、佈飛松(profenofos)、普亞列寧(profluthrin)、毆蟎多(propargite)、普羅三芬丁酯(protrifenbute)、甲醯苯胺類殺蟎劑pyflubumide、派滅淨(pymetrozine)、吡嗪氟蟲脞(pyrafluprole)、除蟲菊精(pyrethrin)、畢達本(pyridaben)、三氟甲吡醚(pyridalyl)、新啞啞啞類殺蟲劑pyrifluquinazon、嘧蟎胺(pyriminostrobin)、皮瑞羅(pyriprole)、百利普芬(pyriproxyfen)、魚藤酮(rotenone)、魚尼丁(ryanodine)、矽護芬(silafluofen)、賜諾特(spinetoram)、多殺菌素(spinosad)、賜派芬(spirodiclofen)、賜滅芬(spiromesifen)、賜派滅(spirotetramat)、硫丙磷(sulprofos)、速殺氟(sulfoxaflor)、得芬諾(tebufenozide)、得芬瑞(tebufenpyrad)、得福隆(teflubenzuron)、七氟菊酯(tefluthrin)、托福松(terbufos)、四氯松(tetrachlorvinphos)、治滅寧(tetramethrin)、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)、賽果培(thiacloprid)、賽速安(thiamethoxam)、硫敵克(thiodicarb)、殺蟲雙(thiosultap-sodium)、脫芬瑞(tolfenpyrad)、泰滅寧(tralomethrin)、啞蚜威(triazamate)、三氯松(trichlorfon)、殺蟲隆(triflumuron)、蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)的所有菌株、昆蟲病原細菌、所有核多角體病毒株、昆蟲病原病毒，以及昆蟲病原真菌。

【第15項】如申請專利範圍第14項之組合物，其中該至少一種額外的生物活性化合物或試劑係選自由下列所組成之群組：阿巴汀(abamectin)、亞滅培

(acetamiprid)、阿納寧(acrinathrin)、雙丙環蟲酯(afidopyropen)、三亞蟎(amitraz)、阿維菌素(avermectin)、印棟素(azadirachtin)、免扶克(benfuracarb)、免速達(bensultap)、畢芬寧(bifenthrin)、3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-(甲基胺基)羰基]苯基]-1H-吡啶-5-甲醯胺、布芬淨(buprofezin)、加保利(carbaryl)、培丹(cartap)、剋安勃(chlorantraniliprole)、克凡派(chlorfenapyr)、陶斯松(chlorpyrifos)、可尼丁(clothianidin)、賽安勃(cyantraniliprole)、環溴蟲醯胺(cyclaniliprole)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、貝他賽扶寧(beta-cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、高效賽洛寧(lambda-cyhalothrin)、伽瑪賽洛寧(gamma-cyhalothrin)、賽滅寧(cypermethrin)、亞滅寧(alpha-cypermethrin)、傑他賽滅寧(zeta-cypermethrin)、賽滅淨(cyromazine)、第滅寧(deltamethrin)、地特靈(dieldrin)、達特南(dinotefuran)、茂醯(diofenolan)、因滅汀(emamectin)、安殺番(endosulfan)、益化利(esfenvalerate)、益斯普(ethiprole)、依芬寧(etofenprox)、依殺蟎(etoxazole)、撲滅松(fenitrothion)、芬硫克(fenothiocarb)、芬諾克(fenoxycarb)、芬化利(fenvalerate)、芬普尼(fipronil)、氟麥托醯(flometoquin)、氟尼胺(flonicamid)、氟大滅(flubendiamide)、氟芬隆(flufenoxuron)、氟菌蟎酯(flufenoxystrobin)、氟速芬(flufensulfone)、丁烯氟蟲腈(flufiprole)、氟吡呋喃酮(flupyradifurone)、福化利(flualinate)、覆滅蟎(formetanate)、福賽絕(fosthiazate)、擬除蟲菊酯類殺蟲劑 heptafluthrin、六伏隆(hexaflumuron)、愛美松(hydramethylnon)、益達胺(imidacloprid)、因得克(indoxacarb)、祿芬隆(lufenuron)、美氟菊酯(meperfluthrin)、美氟綜(metaflumizone)、滅蟲威(methiodicarb)、納乃得(methomyl)、美賜平(methoprene)、滅芬諾(methoxyfenozide)、美特寧(metofluthrin)、美特寧(monofluthrin)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、硝蟲噻嗪(nithiazine)、諾伐隆(novaluron)、

毆殺滅(oxamyl)、甲醯苯胺類殺蟎劑pyflubumide、派滅淨(pymetrozine)、除蟲菊精(pyrethrin)、畢達本(pyridaben)、三氟甲吡醚(pyridalyl)、嘧蟎胺(pyriminostrobin)、百利普芬(pyriproxyfen)、魚尼丁(ryanodine)、賜諾特(spinetoram)、多殺菌素(spinosad)、賜派芬(spirodiclofen)、賜滅芬(spiromesifen)、賜派滅(spirotetramat)、速殺氟(sulfoxaflor)、得芬諾(tebufenozide)、治滅寧(tetramethrin)、賽果培(thiacloprid)、賽速安(thiamethoxam)、硫敵克(thiodicarb)、殺蟲雙(thiosultap-sodium)、泰滅寧(tralomethrin)、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)、啞蚜威(triazamate)、殺蟲隆(triflumuron)、蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)的所有菌株，以及所有核多角體病毒株。

【第16項】一種防治無脊椎害蟲之方法，包含使該無脊椎害蟲或其環境與一生物有效量之如申請專利範圍第1項之化合物接觸。

【第17項】一種經處理之種子，包含一如申請專利範圍第1項之化合物，其量為處理前種子重量的約0.0001至1%。