

發明專利說明書

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：96111451

※申請日期：96.7.30

※IPC 分類：~~A01N, C07D~~

C07D 375/06
C07D 417/06
A01N 43/80

一、發明名稱：(中文/英文)

用於對抗動物害蟲之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物

3-AMINO-1,2-BENZISOTHIAZOLE COMPOUNDS FOR COMBATING
ANIMAL PEST

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

德商巴地斯顏料化工廠

BASF AKTIENGESELLSCHAFT

代表人：(中文/英文)

1. 希奈克
CIMNIAK

2. 瓦隆
WALLON

住居所或營業所地址：(中文/英文)

德國勞域沙芬市

67056 LUDWIGSHAFEN, GERMANY

國 籍：(中文/英文)

德國 GERMANY

三、發明人：(共 8 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 瑪夏斯 玻爾曼
POHLMAN, MATTHIAS
2. 沃夫崗 凡 迪恩
VON DEYN, WOLFGANG
3. 佛洛里恩 凱瑟
KAISER, FLORIAN
4. 恩斯特 鮑曼
BAUMANN, ERNST
5. 麥可 拉克
RACK, MICHAEL
6. 道格拉斯 D 安斯波
ANSPAUGH, DOUGLAS D.
7. 黛伯拉 L 卡伯森
CULBERTSON, DEBORAH L.
8. 亨利 汎 杜爾 卡特
VAN TUL COTTER, HENRY

國 籍：(中文/英文)

1. 德國 GERMANY
2. 德國 GERMANY
3. 德國 GERMANY
4. 德國 GERMANY
5. 德國 GERMANY
6. 美國 U.S.A.
7. 美國 U.S.A.
8. 美國 U.S.A.

四、聲明事項：

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

☒ 申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

☒ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1. 美國；2006年03月31日；60/787,809

2.

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1.

2.

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

九、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

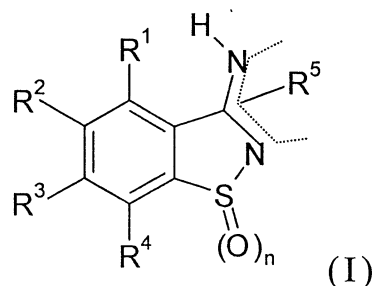
本發明係關於3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物及其異構亞胺基衍生物，且係關於其對映異構體、非對映異構體及鹽且係關於包含此等化合物之組合物。本發明亦係關於3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物、其鹽或包含此等化合物之組合物用於對抗動物害蟲之用途。此外，本發明亦係關於應用此等化合物之方法。

【先前技術】

動物害蟲破壞生長作物及已收穫作物且攻擊木製住宅及商業結構，從而引起食物供應及財產之大量經濟損失。雖然已知大量殺害蟲劑，但由於目標害蟲產生該等藥劑抵抗性之能力，因此，現今需要用於抵抗動物害蟲之新穎藥劑。詳言之，難以有效防治諸如昆蟲及粉蟎科之動物害蟲。

因此，本發明之一目的為提供具有良好殺害蟲活性，尤其抵抗難以防治之昆蟲及粉蟎科之化合物。

現已發現通式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑衍生物解決了此等目標：



其中

n 為 0、1 或 2；

R^1 係選自 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_8 環烷基、 C_3 - C_8 鹵環烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基，其中所提及之基團可未經取代或可攜帶 1、2 或 3 個選自由氰基、硝基、胺基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺基、 C_1 - C_4 烷基磺基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 $(C_1$ - C_4 烷氧基)羰基、 $(C_1$ - C_4 烷基)胺基、二 $(C_1$ - C_4 烷基)胺基、胺基羰基、 $(C_1$ - C_4 烷基)胺基羰基、二 $(C_1$ - C_4 烷基)胺基羰基、 C_3 - C_8 環烷基及苯基組成之群之基團，苯基可未經取代、部分或完全鹵化且/或可攜帶 1、2 或 3 個彼此獨立地選自由 CN、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_1 - C_4 烷氧基及 C_1 - C_4 鹵烷氧基組成之群之取代基，且

R^2 、 R^3 及 R^4 彼此獨立地選自由氫、鹵素、氰基、疊氮基、硝基、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_8 環烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺基、 C_1 - C_4 烷基磺基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 $(C_1$ - C_4 烷氧基)羰基、胺基、 $(C_1$ - C_4 烷基)胺基、二 $(C_1$ - C_4 烷基)胺基、胺基羰基、 $(C_1$ - C_4 烷基)胺基羰基、二 $(C_1$ - C_4 烷基)胺基羰基、磺基、磺基胺基、次磺基胺基、硫基胺基及 $C(=O)-R^{2a}$ 或 $C(=O)-R^{3a}$ 或 $C(=O)-R^{4a}$ 組成之群，且其中 R^{2a} 或 R^{3a} 或 R^{4a} 係選自由氫、羥基、 C_1 - C_6 烷氧基、胺

基、 C_1-C_6 烷基、芳基、芳基- C_1-C_6 烷基、(C_1-C_6 烷基)-胺基、二(C_1-C_6 烷基)-胺基、3至7員雜芳基或雜芳基- C_1-C_4 烷基組成之群，其中該雜芳基環含有作為環成員的1、2或3個選自由氮、氧、硫組成之群的雜原子、基團SO、 SO_2 或 NR^{2b} 或 NR^{3b} 或 NR^{4b} ，且其中 R^{2b} 或 R^{3b} 或 R^{4b} 為氫、 C_1-C_6 烷基或(C_1-C_6 烷基)-羰基；

R^5 係選自由氫、 OR^{5a} 、 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_3-C_{10} 環烷基、芳基- C_1-C_4 烷基、雜芳基- C_1-C_4 烷基、雜環基- C_1-C_4 烷基組成之群，其中此等基團可未經取代、部分或完全鹵化，且/或可攜帶1-4個選自由 C_1-C_{10} 烷氧基、 C_1-C_{10} 烷硫基、 C_1-C_{10} 烷基亞磺醯基、 C_1-C_{10} 烷基磺醯基、 C_1-C_{10} 鹵烷氧基、 C_1-C_{10} 鹵烷硫基、(C_1-C_{10} 烷氧基)羰基、氰基、硝基、胺基、(C_1-C_{10} 烷基)胺基、二(C_1-C_{10} 烷基)胺基、 C_3-C_{10} 環烷基及苯基組成之群之基團，苯基可未經取代、部分或完全鹵化且/或可攜帶1-3個選自由CN、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基組成之群之取代基，且其中

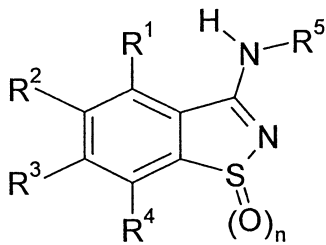
R^{5a} 係選自氫、 C_1-C_{10} 烷基、 C_1-C_{10} 醯基、 C_3-C_{10} 環烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、芳基、芳基- C_1-C_4 烷基、雜芳基及雜芳基- C_1-C_4 烷基、雜環基或雜環基- C_1-C_4 烷基，且其中所有基團可未經取代、部分或完全鹵化且/或可攜帶1、2或3個選自由氰基、硝基、胺基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、

C₁-C₄烷基亞磺基、C₁-C₄烷基磺基、C₁-C₄鹵
 烷氧基、C₁-C₄鹵烷硫基、(C₁-C₄烷氧基)羰基、
 (C₁-C₄烷基)胺基、二(C₁-C₄烷基)胺基及C₃-C₈環
 烷基組成之群之基團；

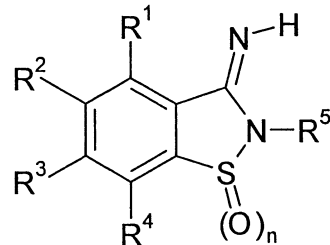
或其對映異構體、非對映異構體或鹽，

其限制條件為若n為0，則R⁵不為氫。

以下兩個異構分子式亦可表示式I。



式 Ia



式 Ib

視取代方式而定，式I化合物可含有一或多個對掌性中心，在該情況下其表現為對映異構體或非對映異構體混合物。本發明之主旨不僅為含有此等混合物之組合物，且亦為彼等含有純對映異構體或非對映異構體之組合物。

DE-A 1915387、WO 03/87072、JP-A 06220030、DE-A 1670920及DE-A 1545842中尤其已描述一些式I化合物。然而，尚未揭示式I化合物之殺昆蟲、殺蟎或殺線蟲活性。

Drabek 已在 EP-A 207891、EP-A 191734、DE-A 3544436、EP-A 138762、EP-A 133418及EP-A 110829中描述胺基-及胺基-經磺化1,2-苯并異噻唑化合物之殺昆蟲活性，或在EP-A 86748中描述3-甲脒基苯并異噻唑1,1-二氧化物之相同用途。JP-A 01319467描述為達成殺昆蟲之目

的而製備N-醯化胺基-苯并異噻唑及其1,2-二氧化物衍生物作為活性成份。EP-A 0033984中描述磺醯基化合物及以經單取代3-胺基-1,2-苯并異噻唑-1,1-二氧化物衍生物為主之殺蚜組合物。後述EP-A 33984中揭示具有殺蚜活性之2-氰基苯磺醯胺。然而，其活性並不令人滿意。WO 2005/035486及未公開國際申請案PCT/EP2006/068469中描述與EP-A 33984類似之化合物。

式I化合物及其農業上可接受之鹽對抵抗動物害蟲(亦即有害節肢動物及線蟲類)，尤其對抵抗難以防治之昆蟲及粉螨科有高度活性。

【發明內容】

因此，本發明係關於通式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物且係關於其農業上有用之鹽。

此外，本發明亦係關於：

- 包含某一量之至少一種式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑衍生物及/或一種其對映異構體、非對映異構體或農業上可接受之鹽及至少一種惰性液體及/或固體農藝上可接受之載劑及視需要使用之至少一種界面活性劑之農業組合物；
- 化合物I及/或一種其對映異構體、非對映異構體或農業上可接受之鹽用於抵抗動物害蟲之用途；
- 一種抵抗動物害蟲之方法，該方法包含使動物害蟲、其棲所、繁殖區域、食物供應、植物、種子、土壤、地區、材料或環境(動物害蟲已生長於其中或可生長於其

中)或待保護以免受動物攻擊或侵襲之材料、植物、種子、土壤、表面或空間與殺害蟲有效量之至少一種如本文所定義之式I化合物及/或一種其對映異構體、非對映異構體或農業上可接受之鹽接觸；

- 一種用於保護作物免受動物害蟲攻擊或侵襲之方法，該方法包含使作物與殺害蟲有效量之至少一種式I化合物及/或至少一種其鹽接觸。

一種用於保護種子免受土壤昆蟲侵害且保護幼苗根及幼芽免受土壤昆蟲及葉昆蟲侵害之方法，該方法包含在播種之前及/或催芽之後使種子與至少一種式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物及/或一種其對映異構體、非對映異構體或農業上可接受之鹽或包含至少一種此類化合物之組合物接觸；且係關於

包含式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物及/或一種其對映異構體、非對映異構體或農業上可接受之鹽之種子。

式I化合物之鹽較佳為農業上可接受之鹽。其可以習用方法形成，例如若式I化合物具有鹼性官能基，則藉由使該化合物與所討論之陰離子之酸反應來形成，或藉由使式I之酸性化合物與合適鹼反應來形成。

合適的農業上有用之鹽尤其為彼等陽離子之鹽或陽離子及陰離子分別對本發明化合物之作用無反作用的彼等酸之酸加成鹽。合適之陽離子尤其為鹼金屬(較佳為鋰、鈉及鉀)、鹼土金屬(較佳為鈣、鎂及鋇)及過渡金屬(較佳為錳、銅、鋅及鐵)之離子，亦及銨(NH_4^+)及其中一至四個氫

原子經 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 羥基烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基、羥基- C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基、苯基或苯甲基置換之經取代銨。經取代銨離子之實例包含甲基銨、異丙基銨、二甲基銨、二異丙基銨、三甲基銨、四甲基銨、四乙基銨、四丁基銨、2-羥基乙基銨、2-(2-羥基乙氧基)乙基銨、雙(2-羥基乙基)銨、苯甲基三甲基銨及苯甲基三乙基銨，此外為鎘離子、銻離子，較佳為三(C_1 - C_4 烷基)鎘及氧化鎘(sulfoxonium)離子，較佳為三(C_1 - C_4 烷基)氧化鎘。

有用酸加成鹽之陰離子主要為氯離子、溴離子、氟離子、硫酸氫根、硫酸根、磷酸二氫根、磷酸氫根、磷酸根、硝酸根、碳酸氫根、碳酸根、六氟矽酸根、六氟磷酸根、苯甲酸根，及 C_1 - C_4 烷酸之陰離子，較佳為甲酸根、乙酸根、丙酸根及丁酸根。其可藉由使式 I 化合物與相應陰離子之酸(較佳為氫氯酸、氫溴酸、硫酸、磷酸或硝酸)反應而形成。

上述變數之定義中所提及之有機部分為(如術語鹵素)個別基團成員之個別列表之集合術語。字首 C_n - C_m 表明各情況中基團中之可能碳原子數。

採用"鹵素"意謂氟基、氯基、溴基及碘基。

採用術語"部分或完全鹵化"意謂特定基團之1或多個(例如1、2、3、4或5個或所有)氫原子可經鹵素原子置換，詳言之可經氟或氯置換。

如本文所用之術語" C_n - C_m 烷基"(且亦在 C_n - C_m 烷基胺基、

二 C_n - C_m 烷基胺基、 C_n - C_m 烷基胺基羰基、二 (C_n - C_m 烷基胺基)羰基、 C_n - C_m 烷硫基、 C_n - C_m 烷基亞磺醯基及 C_n - C_m 烷基磺醯基中)係指具有 n 至 m 個(例如 1 至 10 個)碳原子，較佳 1 至 6 個碳原子之支鏈或無支鏈飽和烴基，例如甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基、1-乙基-2-甲基丙基、庚基、辛基、2-乙基己基、壬基及癸基及其異構體。 C_1 - C_4 烷基意謂(例如)甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基或 1,1-二甲基乙基。

如本文所用之術語" C_n - C_m 鹵烷基"(且亦在 C_n - C_m 鹵烷基亞磺醯基及 C_n - C_m 鹵烷基磺醯基中)係指具有 n 至 m 個碳原子(例如 1 至 10 個，詳言之 1 至 6 個碳原子)(如上所述)之直鏈或支鏈烷基，其中此等基團中之一些或所有氫原子可經如上所述之鹵素原子置換，例如 C_1 - C_4 鹵烷基，諸如氯甲基、溴甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、1-氯乙基、1-溴乙基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-

氟乙基、2,2,2-三氟乙基、五氟乙基及其類似基團。詳言之，術語 C_1 - C_{10} 鹵烷基包含 C_1 - C_2 氟烷基，其與其中1、2、3、4或5個氫原子經氟原子取代之甲基或乙基同義，諸如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基及五氟甲基。

類似地，" C_n - C_m 烷氧基"及" C_n - C_m 烷硫基" (或分別為 C_n - C_m 烷基次磺基)係指具有分別經氧或硫鍵在烷基中之任何鍵上鍵結的 n 至 m 個碳原子(例如1至10個，詳言之1至6個或1至4個碳原子)(如上所述)之直鏈或支鏈烷基。實例包括 C_1 - C_4 烷氧基，諸如甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、丁氧基、第二丁氧基、異丁氧基及第三丁氧基，此外為 C_1 - C_4 烷硫基，諸如甲硫基、乙硫基、丙硫基、異丙硫基及正丁硫基。

因此，術語" C_n - C_m 鹵烷氧基"及" C_n - C_m 鹵烷硫基" (或分別為 C_n - C_m 鹵烷基次磺基)係指具有分別經氧或硫鍵在烷基中之任何鍵上鍵結的 n 至 m 個碳原子(例如1至10個，詳言之1至6個或1至4個碳原子)(如上所述)之直鏈或支鏈烷基，其中此等基團中之一些或全部氫原子可經如上所述之鹵素原子置換，例如 C_1 - C_2 鹵烷氧基，諸如氯甲氧基、溴甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、1-氯乙氧基、1-溴乙氧基、1-氟乙氧基、2-氟乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-

三氯乙氧基及五氟乙氧基，此外為 C_1 - C_2 鹵烷硫基，諸如氯甲硫基、溴甲硫基、二氯甲硫基、三氯甲硫基、氟甲硫基、二氟甲硫基、三氟甲硫基、氯氟甲硫基、二氯氟甲硫基、氯二氟甲硫基、1-氯乙硫基、1-溴乙硫基、1-氟乙硫基、2-氟乙硫基、2,2-二氟乙硫基、2,2,2-三氟乙硫基、2-氯-2-氟乙硫基、2-氯-2,2-二氟乙硫基、2,2-二氯-2-氟乙硫基、2,2,2-三氯乙硫基及五氟乙硫基及其類似基團。類似地，術語 C_1 - C_2 氟烷氧基及 C_1 - C_2 氟烷硫基係指分別經氧原子或硫原子鍵結至分子剩餘部分之 C_1 - C_2 氟烷基。

如本文所用之術語 " C_2 - C_m 烯基" 意謂具有 2 至 m 個 (例如 2 至 10 或 2 至 6 個) 碳原子及在任何位置之雙鍵之支鏈或無支鏈不飽和烴基，諸如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基-乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-1-丁烯基、2-甲基-1-丁烯基、3-甲基-1-丁烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、1,2-二甲基-1-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-1-戊烯基、2-甲基-1-戊烯基、3-甲基-1-戊烯基、4-甲基-1-戊烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-2-戊烯基、4-甲基-2-戊烯基、1-甲基-3-戊烯基、2-甲基-3-戊烯基

基、3-甲基-3-戊烯基、4-甲基-3-戊烯基、1-甲基-4-戊烯基、2-甲基-4-戊烯基、3-甲基-4-戊烯基、4-甲基-4-戊烯基、1,1-二甲基-2-丁烯基、1,1-二甲基-3-丁烯基、1,2-二甲基-1-丁烯基、1,2-二甲基-2-丁烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,3-二甲基-1-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、1,3-二甲基-3-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-1-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、3,3-二甲基-1-丁烯基、3,3-二甲基-2-丁烯基、1-乙基-1-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-乙基-1-丁烯基、2-乙基-2-丁烯基、2-乙基-3-丁烯基、1,1,2-三甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯基、1-乙基-2-甲基-1-丙烯基及1-乙基-2-甲基-2-丙烯基。

如本文所用之術語" C_2-C_m 炔基"係指具有2至 m 個(例如2至10或2至6個)碳原子且含有至少一個參鍵之支鏈或無支鏈不飽和烴基，諸如乙炔基、丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基及其類似基團。

如本文所用之術語" C_1-C_4 烷氧基- C_1-C_4 烷基"係指具有1至4個碳原子之烷基，例如如上所述之特定實例，其中烷基之一氫原子經 C_1-C_4 烷氧基置換。

如本文所用之術語" C_1-C_4 烷硫基- C_1-C_4 烷基"係指具有1至4個碳原子之烷基，其中烷基之一氫原子經 C_1-C_4 烷硫基置換。

如本文所用之術語" C_3-C_m 環烷基"係指單環3至 m 員飽和環脂族基，例如環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚

唑基、噻唑基、噁唑基、噻二唑基、噁二唑基、異噻唑基及異噁唑基。

如本文所用之術語"雜環基-C₁-C₄烷基"及"雜芳基-C₁-C₄烷基"係指非芳族或芳族雜環基，其經C₁-C₄伸烷基鍵結至分子之剩餘部分。

關於式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物之本發明用途，在各情況下各自或組合之取代基及變數之下列含義尤其較佳：

較佳為式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物，其中n為2。

亦較佳為式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物，其中n為1。

同樣較佳為式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物，其中n為0。

較佳為式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物，其中R¹係選自C₁-C₆烷氧基或C₁-C₆鹵烷氧基，詳言之其中R¹係選自C₁-C₆氟烷氧基或C₁-C₆氯烷氧基，諸如三氟甲氧基或三氯甲氧基。

較佳為式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物，其中R²、R³及R⁴彼此獨立地選自由氫、F、Cl、Br或I組成之群。

亦較佳為式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物，其中R²、R³及R⁴獨立為一氫或氟基。

亦尤其較佳為式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物，其中R²、R³及R⁴為氫。

較佳為式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物，其中R⁵係選

自 C_1 - C_6 烷基，其可未經取代、部分或完全鹵化且/或可攜帶 1-4 個選自由 C_1 - C_{10} 烷氧基、 C_1 - C_{10} 烷硫基、 C_1 - C_{10} 烷基亞磺基、 C_1 - C_{10} 烷基磺基、 C_1 - C_{10} 鹵烷氧基、 C_1 - C_{10} 鹵烷硫基、(C_1 - C_{10} 烷氧基)羰基、氰基、硝基、胺基、(C_1 - C_{10} 烷基)胺基、二(C_1 - C_{10} 烷基)胺基、 C_3 - C_{10} 環烷基及苯基組成之群之基團，苯基可未經取代、部分或完全鹵化或可攜帶 1-3 個選自由 CN、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基組成之群之取代基。

亦尤其較佳為式 I 之 3-胺基-1,2 苯并異噻唑化合物，其中 R^5 為氫且 n 為 1 或 2。

在本發明之另一實施例中，式 I 化合物具有 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及 R^5 之以下較佳組合：

式 I 之 3-胺基-1,2 苯并異噻唑化合物，其中 R^1 較佳選自 C_1 - C_6 烷氧基或 C_1 - C_6 鹵烷氧基且 R^2 、 R^3 及 R^4 較佳彼此獨立地選自由氫、F、Cl、Br 或 I 組成之群。

式 I 之 3-胺基-1,2 苯并異噻唑化合物，其中 R^1 較佳選自 C_1 - C_6 烷氧基或 C_1 - C_6 鹵烷氧基且 R^2 、 R^3 及 R^4 較佳為氫。

式 I 之 3-胺基-1,2 苯并異噻唑化合物，其中 R^1 較佳選自 C_1 - C_6 烷氧基或 C_1 - C_6 鹵烷氧基， R^2 、 R^3 及 R^4 較佳彼此獨立地選自由氫、F、Cl、Br 或 I 組成之群，且 R^5 較佳選自 C_1 - C_6 烷基，其可未經取代、部分或完全鹵化且/或可攜帶 1-4 個選自由 C_1 - C_{10} 烷氧基、 C_1 - C_{10} 烷硫基、 C_1 - C_{10} 烷基亞磺基、 C_1 - C_{10} 烷基磺基、 C_1 - C_{10} 鹵烷氧基、 C_1 - C_{10} 鹵烷硫基、(C_1 - C_{10} 烷氧基)羰基、氰基、硝基、胺基、(C_1 - C_{10} 烷

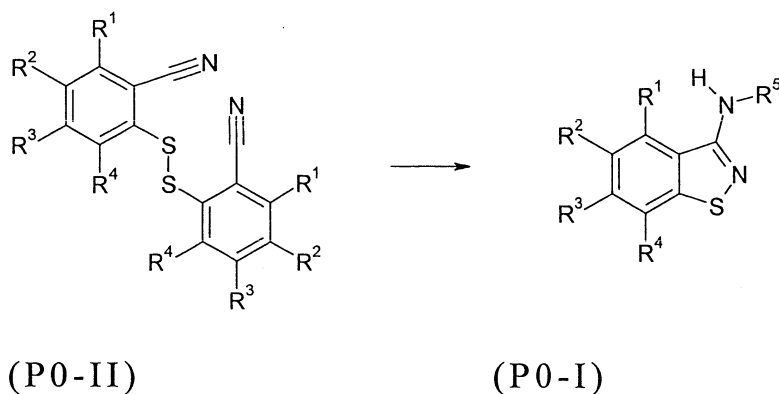
基)胺基、二(C₁-C₁₀烷基)胺基、C₃-C₁₀環烷基及苯基組成之群之基團，苯基可未經取代、部分或完全鹵化且/或可攜帶1-3個選自由CN、C₁-C₆烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆鹵烷氧基組成之群之取代基。

【實施方式】

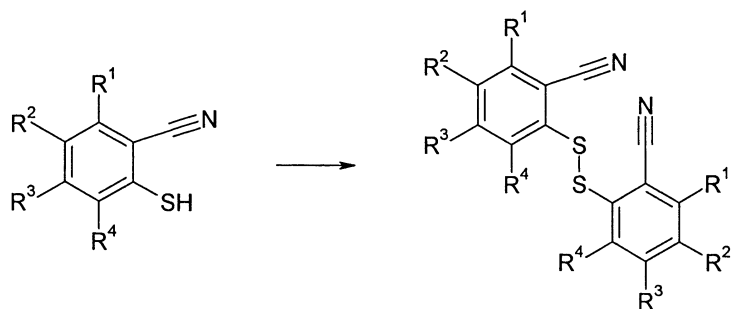
製備方法

P.0. 3-胺基-苯并異噻唑：

如 S. W. Walinsky 等人在 Organic Process Research & Development 1999, 3, 126-130 中所述，可藉由將經合適取代之二硫化物(P0-II)與胺及諸如二甲亞砜(DMSO)之氧化劑一起在諸如異丙醇之極性溶劑中加熱來製備3-胺基-苯并異噻唑(P0-I)。



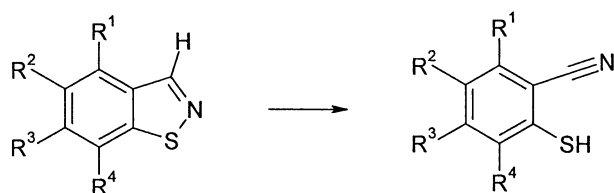
如 H. Boerzel 等人在 Inorganic Chemistry 2003, 1604-1615 中所報導，可藉由使用諸如二甲亞砜(DMSO)之氧化劑自相應硫酚(P0-III)製備2-氰基-二硫化物(P0-II)。



(P0-III)

(P0-II)

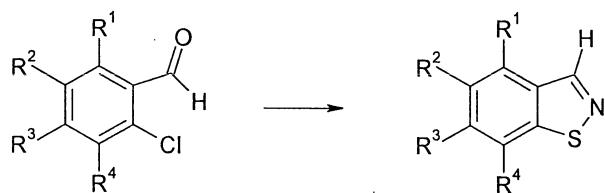
如 J. Markert 等人在 Liebigs Annalen d. Chemie 1980, 768-778 中所述，可藉由以諸如 NaOCH_3 之強鹼進行處理而自苯并異噻唑 (P0-IV) 製備 2-氰基-硫酚 (P0-III)。



(P0-IV)

(P0-III)

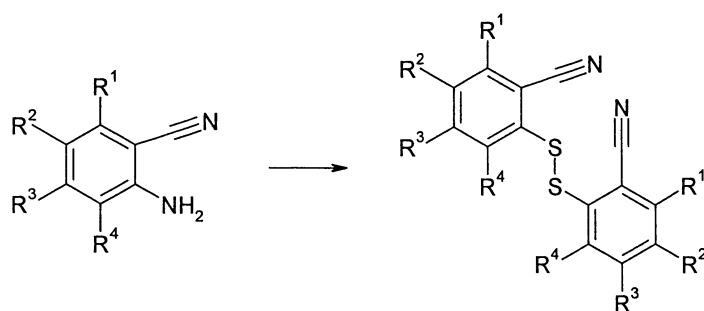
該文章亦描述經由與硫及氮之反應自 2-氯-苯甲醛 (P0-V) 合成經取代之苯并異噻唑 (P0-IV)。



(P0-V)

(P0-IV)

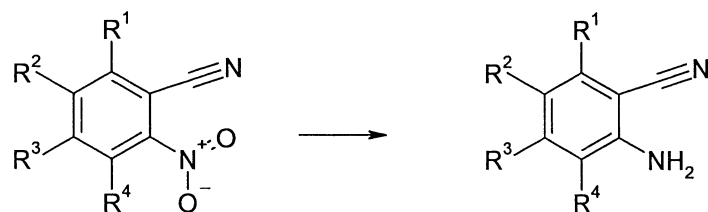
或者，可如 V. M. Negrimovsky 等人在 Phosphorus, Sulfur & The Related Elements 1995, 104, 161-167 中所述，經由重氮化且隨後使重氮鹽與 Na_2S 及硫反應而自 2-氰基-苯胺 (P0-VI) 製備 2-氰基-二硫化物 (P0-II)。



(P0-VI)

(P0-II)

可如 D. H. Klaubert 在 J. Med. Chem. 1981, 24, 742-748 中所述，以諸如鐵之還原劑自 2-氰基-硝基苯 (P0-VII) 製備 2-氰基-苯胺 (P0-VI)。



(P0-VII)

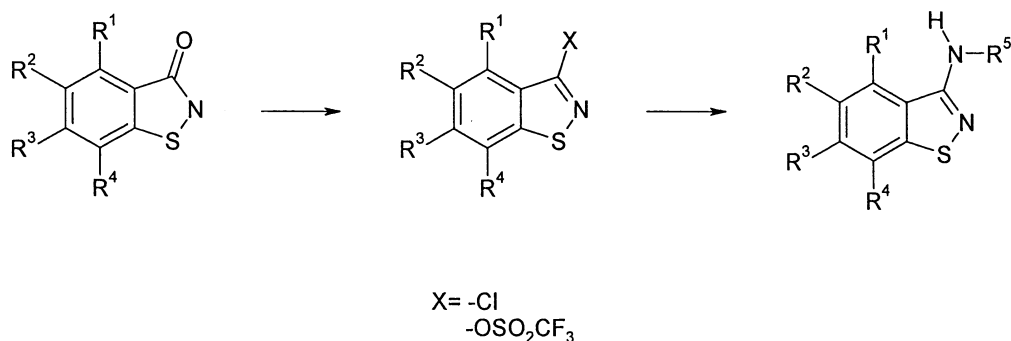
(P0-VI)

或者，亦可如 H. Boeshagen 等人在 Justus Liebig Annalen der Chemie, 1977, 20 中所述，自 3-氯-苯并[d]異噻唑 (P0-VIIIa) 製備 3-胺基-1,2-苯并異噻唑 (P0-I)。

或者，與 US 5359068 類似，可藉由使該等化合物與胺反應自三氟甲磺酸苯并[d]異噻唑-3-基酯 (P0-VIIIb) 獲得其他 3-胺基-1,2-苯并異噻唑 (P0-I)。後述文獻亦描述自苯并異噻唑酮獲得之三氟甲磺酸苯并[d]異噻唑-3-基酯 (P0-VIIIb)。

可藉由與諸如 PCl_3 (J.P. Yevich 等人在 Journal of Medicinal Chemistry 1986, 29, 359-369 中所述) 或 $\text{PCl}_3/\text{PCl}_5$ (S. G. Zlutin 等人, Journal of Organic Chemistry 2000, 65, 8439-

8443)之氯化劑反應自苯并異噻唑酮(P0-IX)獲得氯-苯并[d]異噻唑(P0-VIIIa)。

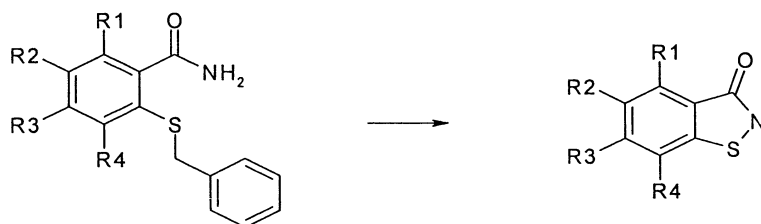


(P0-IX)

(P0-VIIIa/VIIIb)

(P0-I)

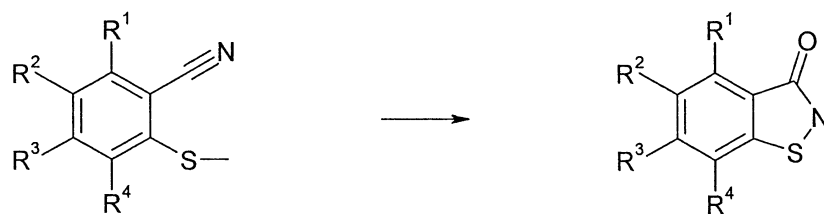
最後所提及之 S.G. Zlutin 等人之文獻亦描述經由以諸如 SO₂Cl₂ 之氧化劑進行處理而自 2-苯甲基硫基-苯甲醯胺 (P0-X) 合成該等苯并異噻唑酮 (P0-IX)。



(P0-X)

(P0-IX)

或者，EP-A 1081141 中描述用於自 2-(烷硫基)苯甲腈 (P0-XI) 製備苯并異噻唑酮 (P0-IX) 之另一方法。



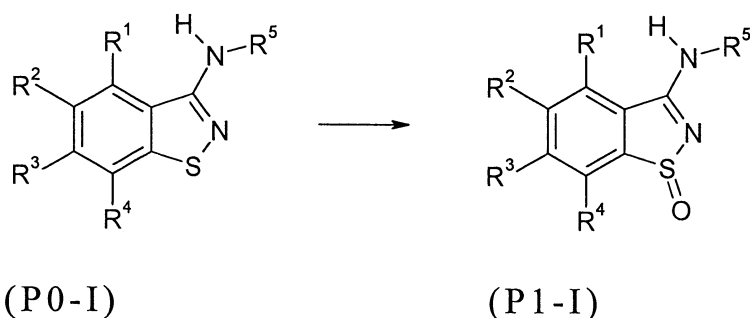
(P0-XI)

(P0-IX)

P.1 胺基苯并異噻唑-1-一氧化物

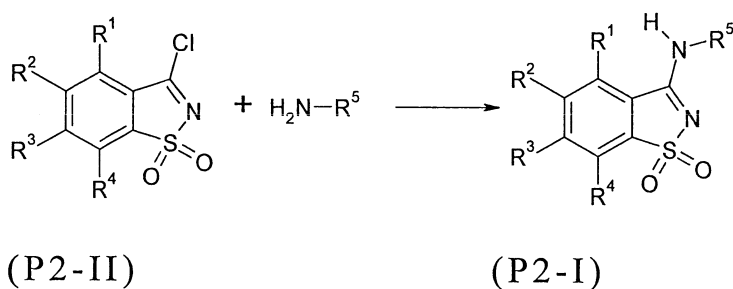
可與 *Chemische Berichte*, 103, 3166-3181 中所述之程序

類似地氧化胺基苯并異噻唑(P0-I)以產生一氧化物質(P1-I)。合適氧化試劑為(例如)HNO₃、H₂O₂/乙酸或間氯-過苯甲酸。

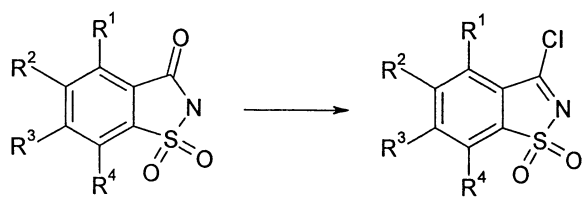


P.2. 3-胺基苯并異噻唑-1,1-二氧化物

可如 *Journal of the Chemical Society Perkin Transaction* 2, 2001, 1315-1324中所述，藉由與第一胺在諸如四氫呋喃或二噁烷之極性、非質子溶劑中反應自經合適取代之3-氯-苯并[d]異噻唑1,1-二氧化物(P2-II)獲得3-胺基苯并異噻唑-1,1-二氧化物(P2-I)。



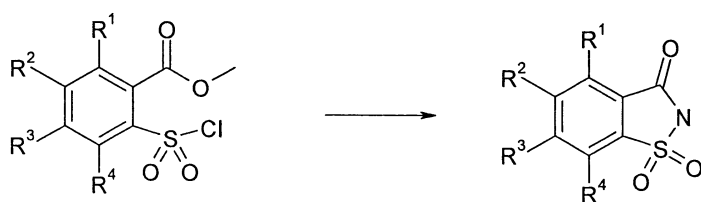
如 D. Dopp 等人在 *Synthesis* 2001, 8, 1228-1235 中、R. Salman 在 *Chem. Eng. Data* 1987, 32, 391 中或 R. W. Lang 在 *Helvetica Chimica Acta* 1989, 72, 1248-1252 中所述，藉由使經合適取代之糖精(P2-III)與諸如 ClCO₂CCl₃、PCl₅/POCl₃ 或 SOCl₂ 之氯化劑反應來製備 3-氯-苯并[d]異噻唑 1,1-二氧化物(P2-II)。



(P2-III)

(P2-II)

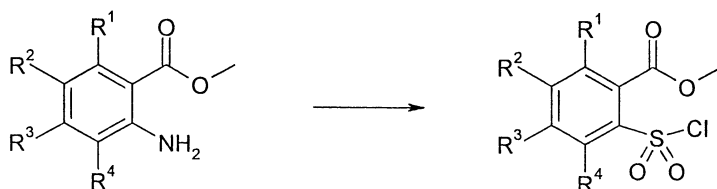
可如 M. C. Bell 等人在 *Bioorganic & Medicinal Letters* 1991, 第 12 期, 733-736 中或 M. L. Trudell 等人在 *Journal of Heterocyclic Chem.* 2004, 41, 435f 中所述, 經由使 2-氯磺醯基-苯甲酸酯 (P2-IV) 與氨反應來製備經取代之糖精 (P2-III)。



(P2-IV)

(P2-III)

後述文章亦描述經由重氮化且隨後經由氯磺化自相應鄰胺基苯甲酸甲酯 (P2-V) 合成所提及之 2-氯磺醯基-苯甲酸酯 (P2-IV)。G. Hamprecht 等人在 *Chimia* (2004), 58, 117-122 中描述類似合成程序。

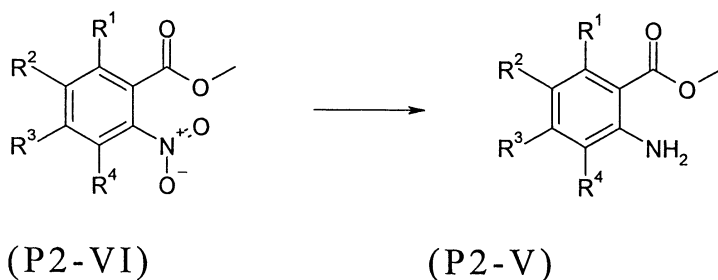


(P2-V)

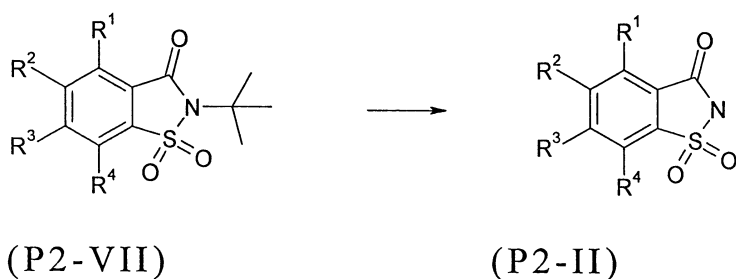
(P2-IV)

在其中鄰胺基苯甲酸甲酯 (P2-V) 並非市售情況下, 其可如 J. F. W. Keana 等人在 *Bioorganic & Medicinal Chemistry* 11 (2003) 1769-1780 中所提及經由催化氫化自相應 2-硝基

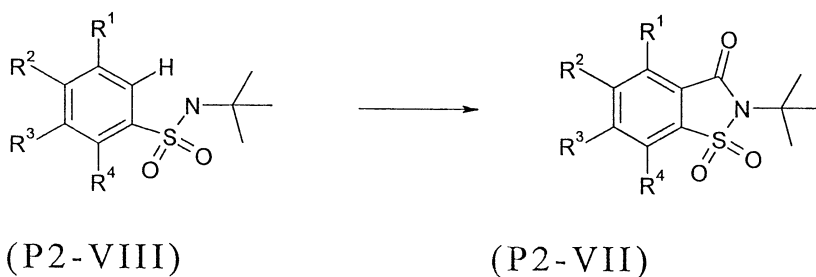
苯甲酸甲酯 (P2-VI) 製備。



或者，可以 K. F. Burri 在 *Helvetica Chimica Acta* 1990, 73, 69-80 中所述之方式經由與諸如三氟乙酸之強酸一起加熱而藉由裂解相應 N-第三丁基糖精 (P2-VII) 來製備糖精 (P2-II)。

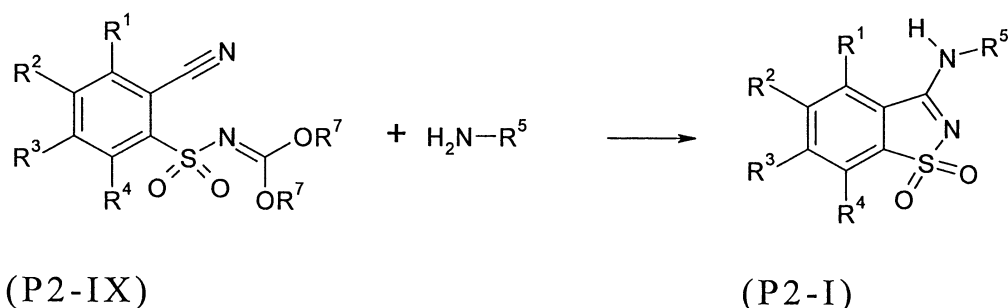


可藉由以諸如丁基鋰或鋰二異丙基胺之鹼定向鄰位金屬化且隨後在閉環作用下以二氧化碳捕集金屬化合物而自相應磺醯胺 (P2-VIII) 獲得 N-第三丁基糖精 (P2-VII)。D. Becker 等人在 *Tetrahedron* 1992, 2515-2522 中描述此程序。可如 N. Murugesan 等人在 *J. Med. Chem.* 1998, 41, 5198-5218 中所述進行金屬化。

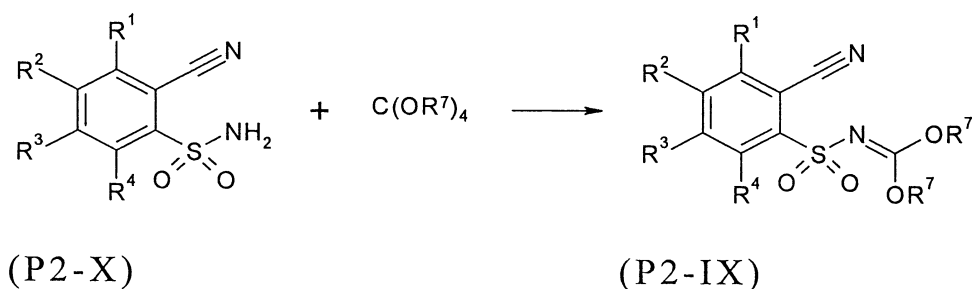


或者，亦可經由在高溫下與第一胺反應自經合適取代之

醯亞胺酯 (P2-IX) 製備 3-胺基-1,2-苯并異噻唑 1,1-二氧化物 (P2-I)。反應可以純的方式進行或在合適溶劑中，較佳在諸如 THF 或二噁烷之極性、高沸點溶劑中進行。反應較佳以純的方式進行。在反應以純的方式進行之情況下，較佳溫度介於室溫與各別胺之沸點之間。在反應在溶劑中進行之情況下，較佳溫度介於室溫與各別溶劑之沸點之間。此方法中，取代基 R^7 較佳為烷基取代基，諸如甲基或乙基。



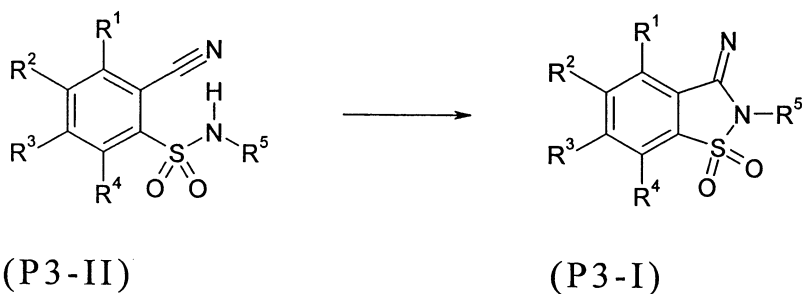
可以 Journal of Organic Chemistry 1963, 28, 2902-2903 中類似描述之方法藉由使 2-氰基苯磺醯胺 (P2-X) 與碳酸原酸酯反應來獲得該等醯亞胺酯 (P2-IX)。可如 WO 2005/035486 中所述製備該等氰基苯磺醯胺 (P2-X)。



P.3. 3-亞胺基糖精

可在鹼性條件下使 *N*-單取代鄰氰基-磺醯胺環化為相應 3-亞胺基糖精。就鹼而言，諸如鹼金屬碳酸鹽之無機鹽較佳。較佳溶劑為極性、水可混溶有機溶劑，諸如二噁烷或

THF。



在所述製備方法中，變數 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及 R^5 具有如上文所定義之含義，尤其為上文所提及之較佳含義。

若個別化合物不可經由上述途徑製備，則其可藉由衍生其他化合物I或藉由慣常修改所述合成途徑來製備。

可以慣常方式來處理反應混合物，例如藉由與水混合、分離各相且(若適當)藉由(例如)在氧化鋁或矽膠上層析而純化粗產物來處理反應混合物。可獲得一些呈無色或淡棕色黏性油狀物形式之中間物及最終產物，其在減壓下且在適度高溫下自揮發性組份釋放或純化。若獲得呈固體形式之中間物及最終產物，則其可藉由再結晶或水解來純化。

可以慣常方式，例如藉由與所討論之陰離子之酸反應來形成式I化合物之農業上可接受之鹽。

表A1至A126中給出式I之較佳化合物之實例，其中在下表A中個別定義 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 ，且亦個別定義n及 R^5 。

表A1： 式I化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為H， R^1 為 CH_3 且其中n及 R^5 如表A之一列中所定義；

表A2： 式I化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為H， R^1 為 C_2H_5 且其中n及 R^5 如表A之一列中所定義；

表A3： 式I化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為H， R^1 為

CF_3 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A4：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為H， R^1 為 OCH_3 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A5：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為H， R^1 為 OC_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A6：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為H， R^1 為 OCF_3 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A7：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為H， R^1 為 OCHF_2 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A8：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為H， R^1 為 OCClF_2 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A9：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為H， R^1 為 OCF_2CHClF 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A10：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為F， R^1 為 CH_3 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A11：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為F， R^1 為 C_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A12：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為F， R^1 為 CF_3 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A13：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為F， R^1 為 OCH_3 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A14：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為F， R^1 為 OC_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

- 表 A15：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 F， R^1 為 OCF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A16：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 F， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A17：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 F， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A18：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 F， R^1 為 OCF_2CHClF 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A19：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 CH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A20：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 C_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A21：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 CF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A22：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 OCH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A23：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 OC_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A24：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 OCF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A25：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A26：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 Cl， R^1 為

OCClF_2 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A27：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 OCF_2CHClF 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A28：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 Br， R^1 為 CH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A29：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 Br， R^1 為 C_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A30：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 Br， R^1 為 CF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A31：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 Br， R^1 為 OCH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A32：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 Br， R^1 為 OC_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A33：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 Br， R^1 為 OCF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A34：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 Br， R^1 為 OCHF_2 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A35：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 Br， R^1 為 OCClF_2 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A36：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 Br， R^1 為 OCF_2CHClF 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A37：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為 H， R^2 為 I， R^1 為

CH_3 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A38： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為I， R^1 為 C_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A39： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為I， R^1 為 CF_3 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A40： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為I， R^1 為 OCH_3 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A41： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為I， R^1 為 OC_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A42： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為I， R^1 為 OCF_3 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A43： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為I， R^1 為 OCHF_2 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A44： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為I， R^1 為 OCClF_2 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A45： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^4 各為H， R^2 為I， R^1 為 OCF_2CHClF 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A46： 式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為H， R^3 為F， R^1 為 CH_3 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A47： 式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為H， R^3 為F， R^1 為 C_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

表 A48： 式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為H， R^3 為F， R^1 為 CF_3 且其中 n 及 R^5 如表A之一列中所定義；

- 表 A49： 式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 F， R^1 為 OCH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A50： 式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 F， R^1 為 OC_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A51： 式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 F， R^1 為 OCF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A52： 式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 F， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A53： 式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 F， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A54： 式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 F， R^1 為 OCF_2CHClF 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A55： 式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 CH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A56： 式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 C_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A57： 式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 CF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A58： 式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 OCH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A59： 式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 OC_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A60： 式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 Cl， R^1 為

OCF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A61：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 OCHF_2 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A62：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 OCClF_2 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A63：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 OCF_2CHClF 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A64：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 Br， R^1 為 CH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A65：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 Br， R^1 為 C_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A66：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 Br， R^1 為 CF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A67：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 Br， R^1 為 OCH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A68：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 Br， R^1 為 OC_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A69：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 Br， R^1 為 OCF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A70：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 Br， R^1 為 OCHF_2 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A71：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 Br， R^1 為 OCClF_2 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

- 表 A72：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 Br， R^1 為 OCF_2CHClF 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A73：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 I， R^1 為 CH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A74：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 I， R^1 為 C_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A75：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 I， R^1 為 CF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A76：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 I， R^1 為 OCH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A77：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 I， R^1 為 OC_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A78：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 I， R^1 為 OCF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A79：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 I， R^1 為 OCHF_2 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A80：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 I， R^1 為 OCClF_2 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A81：式 I 化合物，其中 R^2 及 R^4 各為 H， R^3 為 I， R^1 為 OCF_2CHClF 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A82：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 F， R^1 為 CH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

- 表 A83：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 F， R^1 為 C_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A84：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 F， R^1 為 CF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A85：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 F， R^1 為 OCH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A86：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 F， R^1 為 OC_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A87：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 F， R^1 為 OCF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A88：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 F， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A89：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 F， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A90：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 F， R^1 為 OCF_2CHClF 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A91：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 CH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A92：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 C_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A93：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 CF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；
- 表 A94：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 Cl， R^1 為

OCH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A95：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 Cl， R^1 為

OC_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A96：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 Cl， R^1 為

OCF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A97：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 Cl， R^1 為

OCHF_2 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A98：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 Cl， R^1 為

OCClF_2 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A99：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 Cl， R^1 為

OCF_2CHClF 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A100：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 Br， R^1 為

CH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A101：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 Br， R^1 為

C_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A102：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 Br， R^1 為

CF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A103：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 Br， R^1 為

OCH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A104：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 Br， R^1 為

OC_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A105：式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 Br， R^1 為

OCF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A106： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 Br， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A107： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 Br， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A108： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 Br， R^1 為 OCF_2CHClF 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A109： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 I， R^1 為 CH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A110： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 I， R^1 為 C_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A111： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 I， R^1 為 CF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A112： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 I， R^1 為 OCH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A113： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 I， R^1 為 OC_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A114： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 I， R^1 為 OCF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A115： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 I， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A116： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 I， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A117： 式 I 化合物，其中 R^3 及 R^2 各為 H， R^4 為 I， R^1 為

OCF_2CHClF 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A118：式 I 化合物，其中 R^4 及 R^2 各為 F， R^3 為 H， R^1 為 CH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A119：式 I 化合物，其中 R^4 及 R^2 各為 F， R^3 為 H， R^1 為 C_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A120：式 I 化合物，其中 R^4 及 R^2 各為 F， R^3 為 H， R^1 為 CF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A121：式 I 化合物，其中 R^4 及 R^2 各為 F， R^3 為 H， R^1 為 OCH_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A122：式 I 化合物，其中 R^4 及 R^2 各為 F， R^3 為 H， R^1 為 OC_2H_5 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

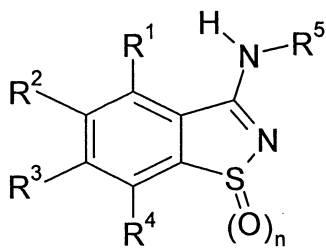
表 A123：式 I 化合物，其中 R^4 及 R^2 各為 F， R^3 為 H， R^1 為 OCF_3 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A124：式 I 化合物，其中 R^4 及 R^2 各為 F， R^3 為 H， R^1 為 OCHF_2 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

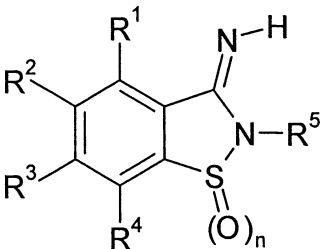
表 A125：式 I 化合物，其中 R^4 及 R^2 各為 F， R^3 為 H， R^1 為 OCClF_2 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

表 A126：式 I 化合物，其中 R^4 及 R^2 各為 F， R^3 為 H， R^1 為 OCF_2CHClF 且其中 n 及 R^5 如表 A 之一列中所定義；

以下兩個異構分子式表示式 I：



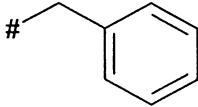
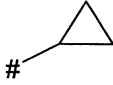
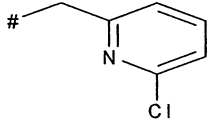
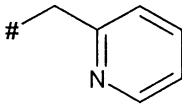
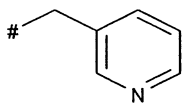
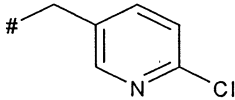
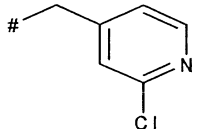
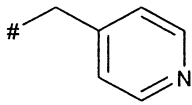
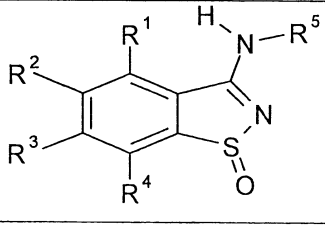
式 Ia

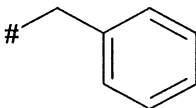
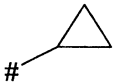
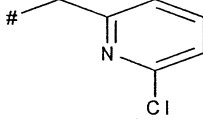
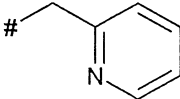
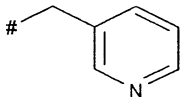


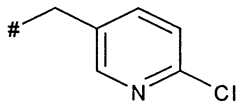
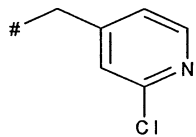
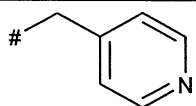
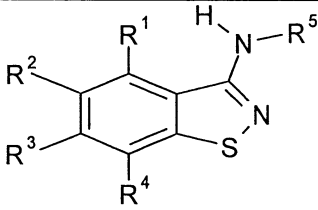
式 Ib

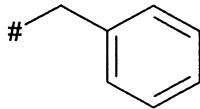
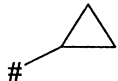
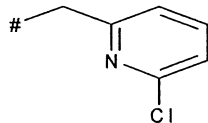
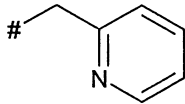
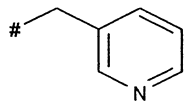
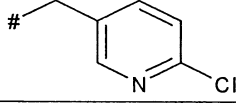
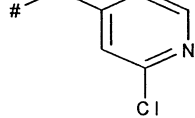
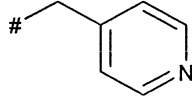
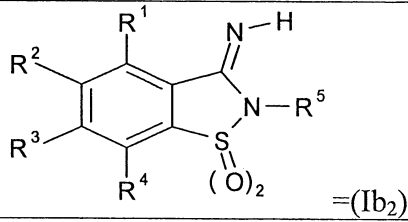
表 A 參照式 I：

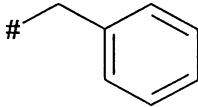
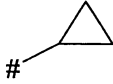
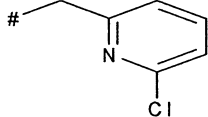
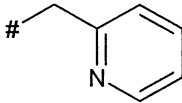
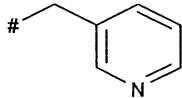
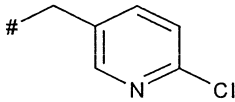
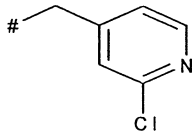
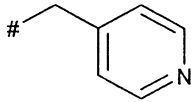
編號	異構分子式 I	R ⁵
1	 =(Ia ₂)	H
2	(Ia ₂)	CH ₃ -
3	(Ia ₂)	CH ₃ CH ₂ -
4	(Ia ₂)	CH ₂ =CH-
5	(Ia ₂)	CH ₃ -O-CH ₂ -
6	(Ia ₂)	ClCH ₂ -CH ₂ -
7	(Ia ₂)	FCH ₂ -CH ₂ -
8	(Ia ₂)	F ₃ C-CH ₂ -
9	(Ia ₂)	Cl ₃ C-CH ₂ -
10	(Ia ₂)	HOCH ₂ -CH ₂ -
11	(Ia ₂)	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
12	(Ia ₂)	(CH ₃) ₂ CH-
13	(Ia ₂)	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
14	(Ia ₂)	CN-CH ₂ -
15	(Ia ₂)	CN-CH ₂ -CH ₂
16	(Ia ₂)	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
17	(Ia ₂)	Cl ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
18	(Ia ₂)	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
19	(Ia ₂)	CH ₃ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
20	(Ia ₂)	CH ₃ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
21	(Ia ₂)	CH ₂ =C(CH ₃)-CH ₂ -
22	(Ia ₂)	CH≡C-CH(CH ₃)-
23	(Ia ₂)	CH≡CH-CH ₂ -
24	(Ia ₂)	(CH ₃) ₃ C-
25	(Ia ₂)	HO
26	(Ia ₂)	CH ₃ O-
27	(Ia ₂)	CH ₃ -CH ₂ -O-
28	(Ia ₂)	(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O
29	(Ia ₂)	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -O
30	(Ia ₂)	CH ₂ =CH-CH ₂ -O-
31	(Ia ₂)	CH ₂ =CH-CH ₂ -

編號	異構分子式 I	R ⁵
32	(Ia ₂)	CH≡C-CH ₂ -O-
33	(Ia ₂)	(CH ₃) ₃ C-O-
34	(Ia ₂)	(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O
35	(Ia ₂)	CH ₃ NH-
36	(Ia ₂)	(CH ₃) ₂ N-
37	(Ia ₂)	C ₂ H ₅ NH-
38	(Ia ₂)	(C ₂ H ₅) ₂ N-
39	(Ia ₂)	CH ₃ CONH-
40	(Ia ₂)	CH ₃ CON(CH ₃)-
41	(Ia ₂)	# 
42	(Ia ₂)	# 
43	(Ia ₂)	# 
44	(Ia ₂)	# 
45	(Ia ₂)	# 
46	(Ia ₂)	# 
47	(Ia ₂)	# 
48	(Ia ₂)	# 
49	 = (Ia ₁)	H
50	(Ia ₁)	CH ₃ -
51	(Ia ₁)	CH ₃ CH ₂ -
52	(Ia ₁)	CH ₂ =CH-
53	(Ia ₁)	CH ₃ -O-CH ₂ -
54	(Ia ₁)	ClCH ₂ -CH ₂ -
55	(Ia ₁)	FCH ₂ -CH ₂ -
56	(Ia ₁)	F ₃ C-CH ₂ -

編號	異構分子式 I	R ⁵
57	(Ia ₁)	Cl ₃ C-CH ₂ -
58	(Ia ₁)	HOCH ₂ -CH ₂ -
59	(Ia ₁)	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
60	(Ia ₁)	(CH ₃) ₂ CH-
61	(Ia ₁)	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
62	(Ia ₁)	CN-CH ₂ -
63	(Ia ₁)	CN-CH ₂ -CH ₂
64	(Ia ₁)	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
65	(Ia ₁)	Cl ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
66	(Ia ₁)	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
67	(Ia ₁)	CH ₃ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
68	(Ia ₁)	CH ₃ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
69	(Ia ₁)	CH ₂ =C(CH ₃)-CH ₂ -
70	(Ia ₁)	CH≡C-CH(CH ₃)-
71	(Ia ₁)	CH≡CH-CH ₂ -
72	(Ia ₁)	(CH ₃) ₃ C-
73	(Ia ₁)	HO
74	(Ia ₁)	CH ₃ O-
75	(Ia ₁)	CH ₃ -CH ₂ -O-
76	(Ia ₁)	(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O
77	(Ia ₁)	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -O
78	(Ia ₁)	CH ₂ =CH-CH ₂ -O-
79	(Ia ₁)	CH ₂ =CH-CH ₂ -
80	(Ia ₁)	CH≡C-CH ₂ -O-
81	(Ia ₁)	(CH ₃) ₃ C-O-
82	(Ia ₁)	(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O
83	(Ia ₁)	CH ₃ NH-
84	(Ia ₁)	(CH ₃) ₂ N-
85	(Ia ₁)	C ₂ H ₅ NH-
86	(Ia ₁)	(C ₂ H ₅) ₂ N-
87	(Ia ₁)	CH ₃ CONH-
88	(Ia ₁)	CH ₃ CON(CH ₃)-
89	(Ia ₁)	
90	(Ia ₁)	
91	(Ia ₁)	
92	(Ia ₁)	
93	(Ia ₁)	

編號	異構分子式 I	R ⁵
94	(Ia ₁)	
95	(Ia ₁)	
96	(Ia ₁)	
97	 =(Ia)	CH ₃ -
98	(Ia)	CH ₃ CH ₂ -
99	(Ia)	CH ₂ =CH-
100	(Ia)	CH ₃ -O-CH ₂ -
101	(Ia)	ClCH ₂ -CH ₂ -
102	(Ia)	FCH ₂ -CH ₂ -
103	(Ia)	F ₃ C-CH ₂ -
104	(Ia)	Cl ₃ C-CH ₂ -
105	(Ia)	HOCH ₂ -CH ₂ -
106	(Ia)	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
107	(Ia)	(CH ₃) ₂ CH-
108	(Ia)	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
109	(Ia)	CN-CH ₂ -
110	(Ia)	CN-CH ₂ -CH ₂
111	(Ia)	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
112	(Ia)	Cl ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
113	(Ia)	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
114	(Ia)	CH ₃ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
115	(Ia)	CH ₃ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
116	(Ia)	CH ₂ =C(CH ₃)-CH ₂ -
117	(Ia)	CH≡C-CH(CH ₃)-
118	(Ia)	CH=CH-CH ₂ -
119	(Ia)	(CH ₃) ₃ C-
120	(Ia)	HO
121	(Ia)	CH ₃ O-
122	(Ia)	CH ₃ -CH ₂ -O-
123	(Ia)	(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O
124	(Ia)	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -O
125	(Ia)	CH ₂ =CH-CH ₂ -O-
126	(Ia)	CH ₂ =CH-CH ₂ -
127	(Ia)	CH≡C-CH ₂ -O-
128	(Ia)	(CH ₃) ₃ C-O-
129	(Ia)	(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O

編號	異構分子式 I	R ⁵
130	(Ia)	CH ₃ NH-
131	(Ia)	(CH ₃) ₂ N-
132	(Ia)	C ₂ H ₅ NH-
133	(Ia)	(C ₂ H ₅) ₂ N-
134	(Ia)	CH ₃ CONH-
135	(Ia)	CH ₃ CON(CH ₃)-
136	(Ia)	
137	(Ia)	
138	(Ia)	
139	(Ia)	
140	(Ia)	
141	(Ia)	
142	(Ia)	
143	(Ia)	
144	 R^1 R^2 R^3 R^4 $\text{N}-\text{H}$ $\text{N}-\text{R}^5$ $\text{S}(\text{O})_2$ $=(\text{Ib}_2)$	CH ₃ -
145	(Ib ₂)	CH ₃ CH ₂ -
146	(Ib ₂)	CH ₂ =CH-
147	(Ib ₂)	CH ₂ =CH-CH ₂ -
148	(Ib ₂)	CH≡CH-CH ₂ -
149	(Ib ₂)	CH ₃ -O-CH ₂ -
150	(Ib ₂)	ClCH ₂ -CH ₂ -
151	(Ib ₂)	FCH ₂ -CH ₂ -
152	(Ib ₂)	F ₃ C-CH ₂ -
153	(Ib ₂)	Cl ₃ C-CH ₂ -
154	(Ib ₂)	HOCH ₂ -CH ₂ -

編號	異構分子式 I	R ⁵
155	(Ib ₂)	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
156	(Ib ₂)	(CH ₃) ₂ CH-
157	(Ib ₂)	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
158	(Ib ₂)	CN-CH ₂ -
159	(Ib ₂)	CN-CH ₂ -CH ₂
160	(Ib ₂)	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
161	(Ib ₂)	Cl ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
162	(Ib ₂)	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
163	(Ib ₂)	CH ₃ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
164	(Ib ₂)	CH ₃ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
165	(Ib ₂)	CH ₂ =C(CH ₃)-CH ₂ -
166	(Ib ₂)	CH≡C-CH(CH ₃)-
167	(Ib ₂)	(CH ₃) ₃ C-
168	(Ib ₂)	
169	(Ib ₂)	
170	(Ib ₂)	
171	(Ib ₂)	
172	(Ib ₂)	
173	(Ib ₂)	
174	(Ib ₂)	
175	(Ib ₂)	

其中，定義 R⁵ 之分子式中 # 表示鍵結至式 I 之鍵；

害蟲

式 I 化合物及其鹽尤其適於有效防治節肢動物害蟲，諸如蜘蛛類節肢動物、多足類節肢動物及昆蟲及線蟲類。

詳言之，其適於防治蟲害，諸如來自以下目之昆蟲：

鱗翅目：例如小地老虎 (*Agrotis ypsilon*)、黃地老虎 (*Agrotis segetum*)、棉葉波紋葉蛾 (*Alabama argillacea*)、黎豆夜蛾 (*Anticarsia gemmatalis*)、蘋實巢蛾 (*Argyresthia conjugella*)、丫紋夜蛾 (*Autographa gamma*)、松樹尺蠖 (*Bupalus piniarius*)、*Cacoecia murinana*、*Capua reticulana*、*Cheimatobia brumata*、雲杉卷葉蛾 (*Choristoneura fumiferana*)、西方雲杉卷葉蛾 (*Choristoneura occidentalis*)、美洲黏蟲 (*Cirphis unipuncta*)、蘋果蠹蛾 (*Cydia pomonella*)、歐洲松毛蟲 (*Dendrolimus pini*)、瓜野螟 (*Diaphania nitidalis*)、巨座玉米螟 (*Diatraea grandiosella*)、埃及金剛鑽 (*Earias insulana*)、小玉米螟 (*Elasmopalpus lignosellus*)、葡萄螟蛾 (*Eupoecilia ambiguella*)、*Evetria bouliana*、粒膚地老虎 (*Feltia subterranea*)、大蠟螟 (*Galleria mellonella*)、李小食心蟲 (*Grapholitha funebrana*)、梨小食心蟲 (*Grapholitha molesta*)、棉鈴蟲 (*Heliothis armigera*)、美洲煙葉蛾 (*Heliothis virescens*)、美洲棉鈴蟲 (*Heliothis zea*)、菜螟 (*Hellula undalis*)、*Hibernia defoliaria*、美國白蛾 (*Hyphantria cunea*)、蘋果巢蛾 (*Hyponomeuta malinellus*)、蕃茄蠹蛾 (*Keiferia lycopersicella*)、鐵杉尺蠖 (*Lambdina fiscellaria*)、甜菜夜蛾 (*Laphygma exigua*)、咖啡潛葉蛾 (*Leucoptera coffeella*)、旋紋潛葉蛾 (*Leucoptera scitella*)、斑幕細蛾 (*Lithocolletis blancardella*)、葡萄漿果小卷蛾

(*Lobesia botrana*)、黃綠條螟(*Loxostege sticticalis*)、舞毒蛾(*Lymantria dispar*)、僧尼毒蛾(*Lymantria monacha*)、窄翅潛葉蛾(*Lyonetia clerkella*)、天幕毛蟲(*Malacosoma neustria*)、甘藍夜蛾(*Mamestra brassicae*)、花旗松毒蛾(*Orgyia pseudotsugata*)、歐洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis*)、冬夜蛾(*Panolis flammea*)、紅鈴蟲(*Pectinophora gossypiella*)、雜色地老虎(*Peridroma saucia*)、圓掌舟蛾(*Phalera bucephala*)、馬鈴薯塊莖蛾(*Phthorimaea operculella*)、橘細潛蛾(*Phyllocnistis citrella*)、大菜粉蛾(*Pieris brassicae*)、苜蓿綠夜蛾(*Plathypena scabra*)、小菜蛾(*Plutella xylostella*)、大豆夜蛾(*Pseudoplusia includens*)、松梢卷葉蛾(*Rhyacionia frustrana*)、*Scrobipalpula absoluta*、麥蛾(*Sitotroga cerealella*)、葡萄長須卷葉蛾(*Sparganothis pilleriana*)、亞熱帶黏蟲(*Spodoptera eridania*)、草地黏蟲(*Spodoptera frugiperda*)、灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis*)、斜紋夜蛾(*Spodoptera litura*)、松異帶蛾(*Thaumatopoea pityocampa*)、櫟綠卷葉蛾(*Tortrix viridana*)、粉紋夜蛾(*Trichoplusia ni*)及雲杉小卷葉蛾(*Zeiraphera canadensis*)，

鞘翅目(甲蟲)，例如梨長吉丁(*Agrilus sinuatus*)、具條叩甲(*Agriotes lineatus*)、黯金針蟲(*Agriotes obscurus*)、馬鈴薯鰓金龜(*Amphimallus solstitialis*)、*Anisandrus dispar*、棉鈴象甲(*Anthonomus grandis*)、蘋果花象甲(*Anthonomus pomorum*)、甜菜隱食甲(*Atomaria linearis*)、

大松小蠹 (*Blastophagus piniperda*)、天幕枯葉蛾
 (*Blitophaga undata*)、蠶豆象 (*Bruchus rufimanus*)、豌豆象
 (*Bruchus pisorum*)、扁豆象 (*Bruchus lentis*)、蘋果卷葉象
 甲 (*Byctiscus betulae*)、甜菜大龜甲 (*Cassida nebulosa*)、豆
 葉甲 (*Cerotoma trifurcata*)、甘藍莢象甲 (*Ceuthorrhynchus*
assimilis)、甘藍莖龜象 (*Ceuthorrhynchus napi*)、甜菜脛跳
 甲 (*Chaetocnema tibialis*)、煙草金針蟲 (*Conoderus*
vespertinus)、天冬負泥甲 (*Crioceris asparagi*)、長角葉甲
 (*Diabrotica longicornis*)、十二星瓜葉甲 (*Diabrotica 12-*
punctata)、玉米根葉甲 (*Diabrotica virgifera*)、墨西哥豆瓢
 蟲 (*Epilachna varivestis*)、煙草跳甲 (*Epitrix hirtipennis*)、
Eutinobothrus brasiliensis、松樹象甲 (*Hylobius abietis*)、
 埃及苜蓿象甲 (*Hypera brunneipennis*)、苜蓿葉象甲
 (*Hypera postica*)、雲杉八齒小蠹 (*Ips typographus*)、具條
 負泥蟲 (*Lema bilineata*)、黑角負泥蟲 (*Lema melanopus*)、
 馬鈴薯甲蟲 (*Leptinotarsa decemlineata*)、甜菜金針蟲
 (*Limonius californicus*)、稻象甲 (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、
 玉米叩甲 (*Melanotus communis*)、油菜露尾甲 (*Meligethes*
aeneus)、忽布鰓角金龜 (*Melolontha hippocastani*)、西方五
 月鰓金龜 (*Melolontha melolontha*)、稻負泥蟲 (*Oulema*
oryzae)、*Ortiorrhynchus sulcatus*、草莓根象甲
 (*Otiorrhynchus ovatus*)、辣根猿葉甲 (*Phaedon cochleariae*)、
Phyllotreta chrysocephala、金龜種 (*Phyllophaga sp.*)、庭
 園麗金龜 (*Phyllopertha horticola*)、蕪菁淡足跳甲

(*Phyllotreta nemorum*)、黃曲條跳甲(*Phyllotreta striolata*)、日本麗金龜(*Popillia japonica*)、豌豆葉象甲(*Sitona lineatus*)及穀象(*Sitophilus granaria*)，

雙翅目，例如埃及伊蚊(*Aedes aegypti*)、刺擾伊蚊(*Aedes vexans*)、墨西哥橘實蠅(*Anastrepha ludens*)、五斑按蚊(*Anopheles maculipennis*)、地中海實蠅(*Ceratitis capitata*)、蛆症金蠅(*Chrysomya bezziana*)、美洲金蠅(*Chrysomya hominivorax*)、稻水蠅(*Chrysomya macellaria*)、高粱癭蚊(*Contarinia sorghicola*)、盾波蠅(*Cordylobia anthropophaga*)、五帶淡色庫蚊(*Culex pipiens*)、瓜實蠅(*Dacus cucurbitae*)、油橄欖實蠅(*Dacus oleae*)、芸苔莢癭蚊(*Dasineura brassicae*)、黃腹廐蠅(*Fannia canicularis*)、大馬胃蠅(*Gasterophilus intestinalis*)、刺舌蠅(*Glossina morsitans*)、騷擾角蠅(*Haematobia irritans*)、*Haplodiplosis equestris*、種蠅(*Hylemyia platura*)、蚊皮蠅(*Hypoderma lineata*)、美洲斑潛蠅(*Liriomyza sativae*)、三葉斑潛蠅(*Liriomyza trifolii*)、山羊綠蠅(*Lucilia caprina*)、銅綠蠅(*Lucilia cuprina*)、絲光綠蠅(*Lucilia sericata*)、*Lycoria pectoralis*、黑森麥桿蠅(*Mayetiola destructor*)、秋家蠅(*Musca autumnalis*)、家蠅(*Musca domestica*)、廐腐蠅(*Muscina stabulans*)、羊鼻蠅(*Oestrus ovis*)、瑞典麥稈蠅(*Oscinella frit*)、甜菜潛葉蠅(*Pegomya hysocyami*)、蔥地草種蠅(*Phorbia antiqua*)、甘藍草種蠅(*Phorbia brassicae*)、麥地草種蠅(*Phorbia coarctata*)、櫻桃實蠅(*Rhagoletis*

cerasi)、蘋果實蠅 (*Rhagoletis pomonella*)、牛虻 (*Tabanus bovinus*)、葉菜大蚊 (*Tipula oleracea*)及歐洲大蚊 (*Tipula paludosa*)，

繭翅目(薊馬)，例如蘭花薊馬屬 (*Dichromothrips spp.*)、煙草褐薊馬 (*Frankliniella fusca*)、苜蓿薊馬 (*Frankliniella occidentalis*)、花薊馬 (*Frankliniella tritici*)、橘實薊馬 (*Scirtothrips citri*)、稻薊馬 (*Thrips oryzae*)、南黃薊馬 (*Thrips palmi*)及煙薊馬 (*Thrips tabaci*)，

膜翅目，例如新疆菜葉蜂 (*Athalia rosae*)、熱帶切葉蟻 (*Atta cephalotes*)、切葉蟻 (*Atta sexdens*)、德州切葉蟻 (*Atta texana*)、李小葉蜂 (*Hoplocampa minuta*)、蘋實葉蜂 (*Hoplocampa testudinea*)、黑花園蟻 (*Lasius niger*)、廚蟻 (*Monomorium pharaonis*)、火蟻 (*Solenopsis geminata*)及紅火蟻 (*Solenopsis invicta*)，

異翅目，例如喜綠蝽 (*Acrosternum hilare*)、多毛長蝽 (*Blissus leucopterus*)、煙草黑斑盲蝽 (*Cyrtopeltis notatus*)、棉紅蝽 (*Dysdercus cingulatus*)、中間紅蝽 (*Dysdercus intermedius*)、麥扁盾蝽 (*Eurygaster integriceps*)、棉褐蝽 (*Euschistus impictiventris*)、葉足緣蝽 (*Leptoglossus phyllopus*)、美國牧草盲蝽 (*Lygus lineolaris*)、牧草盲蝽 (*Lygus pratensis*)、稻綠蝽 (*Nezara viridula*)、甜菜檢網蝽 (*Piesma quadrata*)、*Solubea insularis*及 *Thyanta perditor*，

同翅目(詳言之蚜蟲)，例如驢食草蚜 (*Acyrtosiphon onobrychis*)、落葉松球蚜 (*Adelges laricis*)、桃蚜 (*Aphidula*

nasturtii)、黑豆蚜(*Aphis craccivora*)、蠶豆蚜(*Aphis fabae*)、草螟根蚜(*Aphis forbesi*)、蘋果蚜(*Aphis pomi*)、棉蚜(*Aphis gossypii*)、醋栗蚜(*Aphis grossulariae*)、*Aphis schneideri*、繡線菊蚜(*Aphis spiraecola*)、接骨木蚜(*Aphis sambuci*)、豌豆蚜(*Acyrtosiphon pisum*)、馬鈴薯長須蚜(*Aulacorthum solani*)、煙粉虱(*Bemisa tabaci*)、銀葉粉虱(*Bemisa argentifolii*)、薊短尾蚜(*Brachycaudus cardui*)、圓尾蚜(*Brachycaudus helichrysi*)、桃黑短尾蚜(*Brachycaudus persicae*)、梅蚜(*Brachycaudus prunicola*)、甘藍蚜(*Brevicoryne brassicae*)、角釘毛蚜(*Capitophorus horni*)、*Cerosipha gossypii*、草莓毛管蚜(*Chaetosiphon fragaefolii*)、茶蔗隱瘤額蚜(*Cryptomyzus ribis*)、*Dreyfusia nordmannianae*、*Dreyfusia piceae*、*Dysaphis radicola*、*Dysaulacorthum pseudosolani*、蘋粉紅劣蚜(*Dysaphis plantaginea*)、歐梨圓尾蚜(*Dysaphis pyri*)、蠶豆微葉蟬(*Empoasca fabae*)、梅大尾蚜(*Hyalopterus pruni*)、茶蔗苦菜蚜(*Hyperomyzus lactucae*)、麥長管蚜(*Macrosiphum avenae*)、大戟長管蚜(*Macrosiphum euphorbiae*)、薔薇長管蚜(*Macrosiphon rosae*)、蠶豆修尾蚜(*Megoura viciae*)、*Melanaphis pyrarius*、薔薇麥蚜(*Metopolophium dirhodum*)、煙蚜(*Myzodes persicae*)、冬蔥瘤額蚜(*Myzus ascalonicus*)、櫻桃黑瘤額蚜(*Myzus cerasi*)、桃卷葉蚜(*Myzus varians*)、蒿苳蚜(*Nasonovia ribis-nigri*)、褐稻虱(*Nilaparvata lugens*)、囊柄癭綿蚜(*Pemphigus bursarius*)、蔗飛虱

(*Perkinsiella saccharicida*)、蛇麻疣額蚜(*Phorodon humuli*)、蘋木虱(*Psylla mali*)、梨木虱(*Psylla piri*)、冬蔥縊瘤蚜(*Rhopalomyzus ascalonicus*)、玉米縊管蚜(*Rhopalosiphum maidis*)、禾穀縊管蚜(*Rhopalosiphum padi*)、蘋草縊管蚜(*Rhopalosiphum insertum*)、葉圓尾蚜(*Sappaphis mala*)、蘋果圓尾蚜(*Sappaphis mali*)、麥二叉蚜(*Schizaphis graminum*)、裂鞘葉綿蚜(*Schizoneura lanuginosa*)、麥長管蚜(*Sitobion avenae*)、溫室白粉虱(*Trialeurodes vaporariorum*)、大桔蚜(*Toxoptera aurantiand*)及葡萄根瘤蚜(*Viteus vitifolii*)，

等翅目(白蟻)，例如歐洲木白蟻(*Calotermes flavicollis*)、黃肢散白蟻(*Leucotermes flavipes*)、格蘭散白蟻(*Reticulitermes grassei*)、南歐網紋白蟻(*Reticulitermes lucifugus*)、防犀白蟻(*Reticulitermes santonensis*)及 *Termes natalensis*，

直翅目，例如家蟋蟀(*Acheta domestica*)、東方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、德國小蠊(*Blattella germanica*)、歐洲球螋(*Forficula auricularia*)、歐洲螻蛄(*Gryllotalpa gryllotalpa*)、飛蝗(*Locusta migratoria*)、雙帶蚱蜢(*Melanoplus bivittatus*)、赤腿蚱蜢(*Melanoplus femur-rubrum*)、墨西哥蚱蜢(*Melanoplus mexicanus*)、遷徙蚱蜢(*Melanoplus sanguinipes*)、落磯山蚱蜢(*Melanoplus spretus*)、紅翅蝗(*Nomadacris septemfasciata*)、美洲大蠊(*Periplaneta americana*)、美洲蚱蜢(*Schistocerca americana*)、

Schistocerca peregrina、*Staurotonus maroccanus*及溫室蟋
螽(*Tachycines asynamorus*)，及

彈尾目(跳蟲)，例如棘蟲兆屬(*Onychiurus ssp.*)。

其亦適於防治線蟲類：植物寄生線蟲，諸如根結線蟲
(root knot nematode)，北方根結線蟲(*Meloidogyne hapla*)、南方根結線蟲(*Meloidogyne incognita*)、爪哇根結
線蟲(*Meloidogyne javanica*)及其他根結線蟲屬
(*Meloidogyne*)種；胞囊型線蟲(cyst-forming nematodes)，
馬鈴薯黃金線蟲(*Globodera rostochiensis*)及其他胞囊線蟲
屬(*Globodera*)種；燕麥胞囊線蟲(*Heterodera avenae*)、大
豆胞囊線蟲(*Heterodera glycines*)、甜菜胞囊線蟲
(*Heterodera schachtii*)、三葉草胞囊線蟲(*Heterodera trifolii*)及其他異皮線蟲屬(*Heterodera*)種；種癭線蟲(Seed
gall nematodes)，蛇墊刀屬(*Anguina*)種；莖及葉線蟲(Stem
and foliar nematodes)，滑刀線蟲屬(*Aphelenchoides*)種；
刺線蟲(Sting nematodes)、刺線蟲(*Belonolaimus longicaudatus*)及其他刺線蟲屬(*Belonolaimus*)種；松材線
蟲(Pine nematodes)，松材線蟲(*Bursaphelenchus xylophilus*)
及其他松材線蟲屬(*Bursaphelenchus*)種；環線蟲(Ring
nematodes)，環線蟲屬(*Criconema*)種、小環線蟲屬
(*Criconemella*)種、似環輪線蟲屬(*Criconemoides*)種、中環
屬(*Mesocriconema*)種；莖及鱗莖線蟲(Stem and bulb
nematodes)，馬鈴薯莖線蟲(*Ditylenchus destructor*)、鱗球
莖莖線蟲(*Ditylenchus dipsaci*)及其他雙墊刀屬

(Ditylenchus) 種；錐線蟲 (Awl nematodes)、錐線蟲屬 (Dolichodorus) 種；螺旋線蟲 (Spiral nematodes)，多帶螺旋線蟲 (*Helicotylenchus multicinctus*) 及其他多帶螺旋屬 (Helicotylenchus) 種；鞘線蟲 (Sheath and sheathoid nematodes)，鞘線蟲屬 (Hemicycliophora) 種及半輪屬 (Hemicriconemoides) 種；Hirshmanniella 種；冠線蟲 (Lance nematodes)，冠線蟲屬 (Hoploaimus) 種；假根結線蟲 (false rootknot nematodes)，根瘤線蟲屬 (Nacobbus) 種；針線蟲 (Needle nematodes)，橫帶長針線蟲 (*Longidorus elongatus*) 及其他長針線蟲屬 (Longidorus) 種；根腐線蟲 (Lesion nematodes)，短體根腐線蟲 (*Pratylenchus neglectus*)、穿刺短體線蟲 (*Pratylenchus penetrans*)、彎曲根腐線蟲 (*Pratylenchus curvatus*)、古氏根腐線蟲 (*Pratylenchus goodeyi*) 及其他草地墊刃線蟲屬 (Pratylenchus) 種；穿孔線蟲 (Burrowing nematodes)，穿孔線蟲 (*Radopholus similis*) 及其他內侵線蟲屬 (Radopholus) 種；腎形線蟲 (Reniform nematodes)，旋形線蟲 (*Rotylenchus robustus*) 及其他旋形線蟲屬 (Rotylenchus) 種；盾線蟲屬 (Scutellonema) 種；短粗根線蟲 (Stubby root nematodes)，毛刺線蟲 (*Trichodorus primitivus*) 及其他毛刺線蟲屬 (Trichodorus) 種，擬毛刺線蟲屬 (Paratrichodorus) 種；矮化線蟲 (Stunt nematodes)，矮化線蟲 (*Tylenchorhynchus claytoni*)、矮化線蟲屬 (*Tylenchorhynchus dubius*) 及其他短體線蟲屬 (Tylenchorhynchus) 種；柑橘線蟲 (Citrus nematodes)，墊刃線蟲屬 (Tylenchulus)

種；劍線蟲(Dagger nematodes)，劍線蟲屬(Xiphinema)種；及其他植物寄生線蟲種。

式I化合物及其鹽亦可用於防治蜘蛛類節肢動物(蛛形綱(Arachnoidea))，諸如蜱蟎(Acarina)，例如軟蜱(Argasidae)科、硬蜱(Ixodidae)科及疥蟎(Sarcoptidae)科，諸如美洲花蜱(Amblyomma americanum)、彩飾花蜱(Amblyomma variegatum)、波斯隱喙蜱(Argas persicus)、具環方頭蜱(Boophilus annulatus)、牛蜱(Boophilus decoloratus)、微小牛蜱(Boophilus microplus)、森林革蜱(Dermacentor silvarum)、長喙璃眼蜱(Hyalomma truncatum)、羊硬蜱(Ixodes ricinus)、硬蜱(Ixodes rubicundus)、喙蜱(Ornithodoros moubata)、Otobius megnini、雞皮刺蟎(Dermanyssus gallinae)、羊癢蟎(Psoroptes ovis)、具肢扇頭蜱(Rhipicephalus appendiculatus)、埃氏扇頭蜱(Rhipicephalus evertsi)、疥蟎(Sarcoptes scabiei)及癭蟎科(Eriophyidae spp.)，諸如蘋刺癭蟎(Aculus schlechtendali)、橘鏽蟎(Phyllocoptrata oleivora)及柑桔癭蟎(Eriophyes sheldoni)；跗線蟎科(Tarsonemidae spp.)，諸如Phytonemus pallidus及多食跗線蟎(Polyphagotarsonemus latus)；細須蟎科(Tenuipalpidae spp.)，諸如紫紅短須蟎(Brevipalpus phoenicis)；葉蟎科(Tetranychidae spp.)，諸如朱砂葉蟎(Tetranychus cinnabarinus)、神澤氏葉蟎科(Tetranychus kanzawai)、太平洋紅葉蟎(Tetranychus pacificus)、棉紅葉蟎(Tetranychus telarius)及棉葉蟎(Tetranychus urticae)、蘋

果紅蜘蛛(*Panonychus ulmi*)、橘全爪蟎(*Panonychus citri*)及草地小爪蟎(*oligonychus pratensis*)。

式I化合物尤其可用於防治昆蟲，較佳為吸式或刺式昆蟲，諸如來自纓翅目、膜翅目、直翅目及同翅目屬，尤其來自下列各種之昆蟲：

纓翅目(薊馬)：煙草褐薊馬、苜蓿薊馬、花薊馬、橘實薊馬、稻薊馬、南黃薊馬及煙薊馬，

膜翅目：新疆菜葉蜂、熱帶切葉蟻、切葉蟻、德州切葉蟻、李小葉蜂、蘋實葉蜂、廚蟻、火蟻及紅火蟻，

直翅目：蟋蟀、東方蜚蠊、德國小蠊、歐洲球蝨、歐洲螻蛄、飛蝗、雙帶蚱蜢、赤腿蚱蜢、墨西哥蚱蜢、遷徙蚱蜢、落磯山蚱蜢、紅翅蝗、美洲大蠊、美洲蚱蜢、*Schistocerca peregrina*、*Stauronotus maroccanus*及溫室蟋蟀；

同翅目，詳言之為蚜蟲：驢食草蚜、落葉松球蚜、桃蚜、蠶豆蚜、草螟根蚜、蘋果蚜、棉蚜、醋栗蚜、*Aphis schneideri*、繡線菊蚜、接骨木蚜、豌豆蚜、馬鈴薯長須蚜、薊短尾蚜、圓尾蚜、桃黑短尾蚜、梅蚜、甘藍蚜、角釘毛蚜、*Cerosipha gossypii*、草莓毛管蚜、茶藨隱瘤額蚜、*Dreyfusia nordmannianae*、*Dreyfusia piceae*、*Dysaphis radicola*、*Dysaulacorthum pseudosolani*、蘋粉紅劣蚜、歐梨圓尾蚜、蠶豆微葉蟬、梅大尾蚜、茶藨苦菜蚜、麥長管蚜、大戟長管蚜、薔薇長管蚜、蠶豆修尾蚜、*Melanaphis pyrae*、薔薇麥蚜、煙蚜、冬蔥瘤額蚜、櫻

桃黑瘤額蚜、桃卷葉蚜、蒿苳蚜、褐稻虱、囊柄癭綿蚜、蔗飛虱、蛇麻疣額蚜、蘋木虱、梨木虱、冬蔥縊瘤蚜、玉米縊管蚜、禾穀縊管蚜、蘋草縊管蚜、葉圓尾蚜、蘋果圓尾蚜、麥二叉蚜、裂鞘葉綿蚜、麥長管蚜、溫室白粉虱、大桔蚜及葡萄根瘤蚜；

式I化合物尤其可用於防治同翅目及縷翅目昆蟲，且更佳可用於防治蚜蟲。

調配物

為用於本發明之方法中，可將化合物I轉化為慣常調配物，例如溶液、乳液、懸浮液、粉塵、粉末、漿料、顆粒及可直接噴霧溶液。使用形式取決於特定目的及應用方法。選擇調配物及應用方法以確保在各情況下本發明之式I化合物之精細及均一分佈。

以已知方式(參見，例如回顧US 3,060,084、EP-A 707 445(關於液體濃縮物)，Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 1967年12月4日，147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook，第4版，McGraw-Hill, New York, 1963，第8-57頁；及下列WO 91/13546、US 4,172,714、US 4,144,050、US 3,920,442、US 5,180,587、US 5,232,701、US 5,208,030、GB 2,095,558、US 3,299,566; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961; Hance等人，Weed Control Handbook，第8版，Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989;及Mollet, H., Grubemann, A., Formulation

technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Germany), 2001, 2; D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8))製備調配物，例如藉由以適於調配農用化學品之助劑擴展活性化合物來製備調配物，該等助劑諸如溶劑及/或載劑、視需要使用之乳化劑、界面活性劑及分散劑、防腐劑、消泡劑、防凍劑、亦視情況用於種子處理調配之著色劑及/或黏合劑及/或膠凝劑。

合適溶劑/載劑為(例如)：

- 溶劑，諸如水、芳族溶劑(例如 Solvesso 產品、二甲苯及其類似物)、石蠟(例如礦物餾份)、醇類(例如甲醇、丁醇、戊醇、苯甲醇)、酮類(例如環己酮、 γ -丁內酯)、吡咯啉酮類(N-甲基-吡咯啉酮(NMP)、N-辛基吡咯啉酮NOP)、乙酸酯類(乙二醇二乙酸酯)、烷基乳酸酯、諸如 γ -丁內酯之內酯類、二醇類、脂肪酸二甲醯胺類、脂肪酸及脂肪酸酯類、甘油三酸酯類、植物源或動物源油類及諸如烷基化植物油之經改質油類。通常亦可使用溶劑混合物。
- 載劑，諸如經研磨天然礦物及經研磨合成礦物，諸如矽膠、細粉狀矽酸、矽酸鹽類、滑石、高嶺土、美國活性白土(attaclay)、石灰石、石灰、白堊、紅玄武土(bole)、黃土、黏土、白雲石、矽藻土、硫酸鈣及硫酸鎂、氧化鎂、經研磨合成材料、肥料(諸如硫酸銨、磷

酸銨、硝酸銨、尿素)及植物源產品(諸如穀物粗粉、樹皮粗粉、木粉及堅果粗粉、纖維素粉末)及其他固體載劑。

合適乳化劑為非離子及陰離子乳化劑(例如聚環氧乙烷脂肪醇醚、烷基磺酸酯及芳基磺酸酯)。

分散劑之實例為木質素亞硫酸鹽廢液及甲基纖維素。

合適界面活性劑為木質磺酸、萘磺酸、酚磺酸磺酸、酚磺酸、二丁基萘磺酸、烷基芳基磺酸酯、烷基硫酸酯、烷基磺酸酯、脂肪醇硫酸酯、脂肪酸及硫酸化脂肪醇二醇醚之鹼金屬、鹼土金屬及銨鹽，此外為磺化萘及萘衍生物與甲醛之縮合物、萘或萘磺酸與苯酚及甲醛之縮合物、聚環氧乙烷辛基苯基醚、乙氧基化異辛基酚、辛基酚、壬基酚、烷基苯基聚乙二醇醚、三丁基苯基聚乙二醇醚、三硬脂醯基苯基聚乙二醇醚、烷基芳基聚醚醇類、醇及脂肪醇/環氧乙烷縮合物、乙氧基化蓖麻油、聚環氧乙烷烷基醚、乙氧基化聚環氧丙烷、月桂醇聚乙二醇醚縮醛、山梨糖醇酯。

亦可將諸如甘油、乙二醇、丙二醇之防凍劑及殺菌劑(諸如)添加至調配物中。

合適消泡劑為(例如)以硬脂酸矽或硬脂酸鎂為主之消泡劑。

合適防腐劑為(例如)二氯酚(dichlorophen)及苯甲醇半甲縮醛。

合適增稠劑為賦予調配物假塑性流動行為(亦即在靜止

階段賦予高黏度且在攪動階段賦予低黏度)之化合物。本文中可提及(例如)以多醣為主之市售增稠劑，諸如 Xanthan Gum[®](來自 Kelco 之 Kelzan[®])、Rhodopol[®] 23(Rhone Poulenc)或 Veegum[®](來自 R.T. Vanderbilt)或有機頁矽酸鹽，諸如 Attaclay[®](來自 Engelhardt)。適於本發明之分散劑之消泡劑為(例如)聚矽氧乳液(諸如 Silikon[®] SRE、Wacker 或來自 Rhodia 之 Rhodorsil[®])、長鏈醇類、脂肪酸類、有機氟化合物及其混合物。可添加殺生物劑以使本發明之組合物穩定抵抗微生物之攻擊。舉例而言，合適殺生物劑以異噻唑酮為主，諸如來自 Avecia(或 Arch)之以商標 Proxel[®] 市售或來自 Thor Chemie 之以 Acticide[®] RS 市售及來自 Rohm & Haas 之以 Kathon[®] MK 市售之化合物。合適防凍劑為有機多元醇，例如乙二醇、丙二醇或甘油。以活性化合物組合物之總重量計，此等物質通常以至多 10 重量%之量使用。若適當，則本發明之活性化合物組合物可包含以所製備調配物之總量計 1 至 5 重量%之緩衝液以調節 pH 值，其中所用緩衝液之量及類型取決於活性化合物之化學特性。緩衝液之實例為弱無機酸或有機酸(諸如磷酸、硼酸、乙酸、丙酸、檸檬酸、反丁烯二酸、酒石酸、草酸及丁二酸)之鹼金屬鹽。

適於製備可直接噴霧溶液、乳液、漿料或油分散液之物質為中等至高沸點礦物油餾份(諸如煤油或柴油，此外為煤焦油及植物源或動物源油)、脂族烴、環烴及芳族烴(例如甲苯、二甲苯、石蠟、四氫化萘、烷基化萘或其衍生

物、甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、環己醇、環己酮、異佛爾酮)、強極性溶劑(例如二甲亞砜、N-甲基吡咯啉酮及水)。

可藉由將活性物質與固體載劑混合或相伴性研磨來製備粉末、用於延展之材料及粉塵。

可藉由使活性成份與固體載劑結合來製備顆粒，例如經塗佈顆粒、浸漬顆粒及均質顆粒。固體載劑之實例為礦物土(諸如矽膠、矽酸鹽、滑石、高嶺土、美國活性白土、石灰石、石灰、白堊、紅玄武土、黃土、黏土、白雲石、矽藻土、硫酸鈣、硫酸鎂、氧化鎂)、經研磨之合成材料、肥料(諸如硫酸銨、磷酸銨、硝酸銨、尿素)及植物源產品(諸如穀物粗粉、樹皮粗粉、木粉及堅果粗粉)、纖維素粉末及其他固體載劑。

調配物通常包含0.01至95重量%，較佳0.1至90重量%之活性成份。採用純度為90%至100%，較佳95%至100%之活性成份(根據NMR光譜)。

為達成種子處理之目的，可將各別調配物稀釋2至10倍，導致即用製劑中活性化合物濃度為0.01至60重量%，較佳0.1至40重量%。

式I化合物可藉助於噴霧、霧化、噴粉、延展或澆注同樣以其調配物形式或從中製備之使用形式(例如以可直接噴霧溶液、粉末、懸浮液或分散液、乳液、油分散液、漿料、可噴粉產物、延展材料，或顆粒之形式)使用。使用形式完全取決於所欲達成之目的，其意在確保各情況下本發明之活性化合物最精細之可能分佈。

以下為調配物之實例：

1.用於以水稀釋之產物。為達成種子處理之目的，此等產物可經稀釋或不經稀釋應用於種子。

A)水溶性濃縮物(SL, LS)

將10重量份活性化合物溶解於90重量份水或水溶性溶劑中。或者，添加濕潤劑或其他助劑。活性化合物經水稀釋即溶解，由此獲得含有10%(w/w)活性化合物之調配物。

B)可分散濃縮物(DC)

將20重量份活性化合物溶解於70重量份環己酮中，同時添加10重量份例如聚乙烯吡咯啶酮之分散劑。以水稀釋而產生分散液，由此獲得含有20%(w/w)活性化合物之調配物。

C)可乳化濃縮物(EC)

將15重量份活性化合物溶解於7重量份二甲苯中，同時添加十二烷基苯磺酸鈣及乙氧基化蓖麻油(兩者各為5重量份)。以水稀釋而產生乳液，由此獲得含有15%(w/w)活性化合物之調配物。

D)乳液(EW, EO, ES)

將25重量份活性化合物溶解於35重量份二甲苯中，同時添加十二烷基苯磺酸鈣及乙氧基化蓖麻油(兩者各為5重量份)。藉助於乳化機(例如Ultraturrax)將此混合物引入30重量份水中且製成均質乳液。以水稀釋而產生乳液，由此獲得含有25%(w/w)活性化合物之調配物。

E)懸浮液(SC, OD, FS)

在攪動式球磨機中，將20重量份活性化合物粉碎，同時添加10重量份分散劑、濕潤劑及70重量份水或有機溶劑以產生精細活性化合物懸浮液。以水稀釋而產生活性化合物之穩定懸浮液，由此獲得含有20%(w/w)活性化合物之調配物。

F)水分散性顆粒及水溶性顆粒(WG，SG)

將50重量份活性化合物精細研磨，同時添加50重量份分散劑及濕潤劑且藉助於技術設備(例如擠壓機、噴霧塔、流化床)製成水分散性或水溶性顆粒。以水稀釋而產生活性化合物之穩定分散液或溶液，由此獲得含有50%(w/w)活性化合物之調配物。

G)水分散性粉末及水溶性粉末(WP，SP，SS，WS)

在轉子-定子研磨機中研磨75重量份活性化合物，同時添加25重量份分散劑、濕潤劑及矽膠。以水稀釋而產生活性化合物之穩定分散液或溶液，由此獲得含有75%(w/w)活性化合物之調配物。

H)凝膠調配物(GF)

在攪動式球磨機中，將20重量份活性化合物粉碎，同時添加10重量份分散劑、1重量份膠凝劑濕潤劑及70重量份水或有機溶劑以產生精細活性化合物懸浮液。以水稀釋而產生活性化合物之穩定懸浮液，由此獲得含有20%(w/w)活性化合物之調配物。

2.供葉部應用之不經稀釋而應用之產物。為達成種子處理之目的，此等產物可經稀釋或不經稀釋應用於種子。

I)可噴粉粉末(DP, DS)

將5重量份活性化合物精細研磨且與95重量份細粉狀高嶺土精細混合。此產生含有5%(w/w)活性化合物之可噴粉產物。

J)顆粒(GR, FG, GG, MG)

將0.5重量份活性化合物精細研磨且與95.5重量份載劑組合，由此獲得含有0.5%(w/w)活性化合物之調配物。目前之方法為擠壓、噴霧乾燥或流化床。此產生供葉部使用之不經稀釋而應用之顆粒。

K)ULV溶液(UL)

將10重量份活性化合物溶解於90重量份例如二甲苯之有機溶劑中。此產生含有10%(w/w)活性化合物之產物，其不經稀釋而用於供葉部使用。

可藉由添加水而自乳液濃縮物、漿料或可濕粉末(可噴霧粉末、油分散液)製備水性使用形式。為製備乳液、漿料或油分散液，該等以其本身使用或溶解於油或溶劑中之物質可藉助於濕潤劑、增黏劑、分散劑或乳化劑而於水中均質化。或者，可製備由活性物質、濕潤劑、增黏劑、分散劑或乳化劑及(若適當)溶劑或油狀物構成之濃縮物，且此等濃縮物適於以水稀釋。

即用產物中活性成份之濃度可在相對廣泛範圍內變化。變化範圍通常為0.0001至10%，較佳為0.01至1%。

活性成份亦可成功用於超低容量法(ULV)，其中可應用包含超過95重量%之活性成份之調配物，或甚至可應用不

含添加劑之活性成份。

在本發明之方法中，化合物I可與其他活性成份一起應用，例如與其他殺害蟲劑、殺昆蟲劑、除草劑、諸如硝酸銨、尿素、鉀鹼及過磷酸鹽之肥料、植物毒素及植物生長調節劑、安全劑及殺線蟲劑一起應用。此等額外成份可與上述組份相繼或組合使用，若適當亦可僅在使用前即刻加入(槽式混合)。舉例而言，可在以其他活性成份處理之前或之後以本發明之組合物對植物進行噴霧。

可與本發明之化合物一起使用且可與其一起產生潛在協同作用之下列清單M之殺害蟲劑意欲說明可能之組合，但不欲強加任何限制。

M.1.有機(硫基)磷酸酯：歐殺松(acephate)、甲基吡啶磷(azamethiphos)、乙基穀硫磷(azinphos-ethyl)、穀硫磷(azinphos-methyl)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、氯芬磷(chlorfenvinphos)、氯甲磷(chlormephos)、毒死蜱(chlorpyrifos)、甲基毒死蜱(chlorpyrifos-methyl)、庫馬磷(coumaphos)、殺螟腈(cyanophos)、滅賜松(demeton-S-methyl)、敵匹硫磷(diazinon)、敵敵畏/DDVP(dichlorvos/DDVP)、百治磷(dicrotophos)、大滅松(dimethoate)、甲基毒蟲畏(dimethylvinphos)、乙拌磷(disulfoton)、EPN、乙硫磷(ethion)、普伏松(ethoprophos)、氯磷磷(famphur)、芬滅松(fenamiphos)、撲滅松(fenitrothion)、倍硫磷(fenthion)、吡唑磷(flupyrzaphos)、噻唑膦(fosthiazate)、庚烯磷(heptenophos)、

異噁唑磷(isoxathion)、馬拉硫磷(malathion)、滅蚜磷(mecarbam)、甲胺磷(methamidophos)、殺撲磷(methidathion)、速滅磷(mevinphos)、久效磷(monocrotophos)、乃力松(naled)、毆滅松(omethoate)、滅多松(oxydemeton-methyl)、對硫磷(parathion)、甲基對硫磷(parathion-methyl)、賽達松(phenthoate)、甲拌磷(phorate)、伏殺磷(phosalone)、亞胺硫磷(phosmet)、福賜米松(phosphamidon)、巴賽松(phoxim)、蟲蟊磷(pirimiphos-methyl)、丙溴磷(profenofos)、巴胺磷(propetamphos)、丙硫磷(prothiofos)、白克松(pyraclofos)、必芬松(pyridaphenthion)、喹硫磷(quinalphos)、治螟磷(sulfotep)、丁噠硫磷(tebupirimfos)、替美磷(temephos)、託福松(terbufos)、司替羅磷(tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷(thiometon)、三唑磷(triazophos)、三氯松(trichlorfon)、繁米松(vamidothion)；

M.2. 胺基甲酸酯：得滅克(aldicarb)、棉靈威(alanycarb)、免敵克(bendiocarb)、本夫克(benfuracarb)、丁酮威(butocarboxim)、丁酮砒威(butoxycarboxim)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、丁基加保扶(carbosulfan)、苯蟲威(ethiofencarb)、丁基滅必虱(fenobucarb)、複滅蟊(formetanate)、夫硫克(furathiocarb)、滅必虱(isoprocarb)、滅蟲威(methiocarb)、滅多蟲(methomyl)、速滅威(metolcarb)、歐

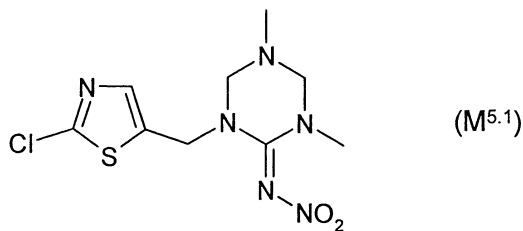
殺滅(oxamyl)、比加普(pirimicarb)、殘殺威(propoxur)、硫雙威硫雙威(thiodicarb)、久效威(thiofanox)、混滅威(trimethacarb)、XMC、滅殺威(xylylcarb)、啞蛭威(triazamate)；

M.3.擬除蟲菊酯(Pyrethroid)：阿納寧(acrinathrin)、丙烯除蟲菊(allethrin)、d-順-反亞列寧(d-cis-trans allethrin)、d-反亞列寧(d-trans allethrin)、畢芬寧(bifenthrin)、生物丙烯除蟲菊(bioallethrin)、生物丙烯除蟲菊-S-環戊烯基(bioallethrin S-cyclopentenyl)、卡呋菊酯(bioresmethrin)、乙氰菊脂(cycloprothrin)、西福寧(cyfluthrin)、 β -氰氯氰菊酯(beta-yfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、 λ -賽洛寧、 γ -賽洛甯、賽滅寧(cypermethrin)、 α -賽滅寧、 β -賽滅寧、 θ -賽滅寧、 ζ -賽滅寧、苯醚氰菊酯(cyphenothrin)、第滅寧(deltamethrin)、烯炔菊酯(empenthrin)、伊芬化利(esfenvalerate)、依芬寧(etofenprox)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、護賽寧(flucythrinate)、氯氯苯菊酯(flumethrin)、 τ -氯胺氰菊酯(tau-fluvalinate)、合芬寧(halfenprox)、依普寧(imiprothrin)、百滅寧(permethrin)、苯醚菊酯(phenothrin)、丙炔菊酯(prallethrin)、苜呋菊酯(resmethrin)、RU 15525、西拉福芬(silafluofen)、七氯菊酯(tefluthrin)、胺菊酯(tetramethrin)、泰滅寧(tralomethrin)、四氯菊酯(transfluthrin)、ZXI 8901；

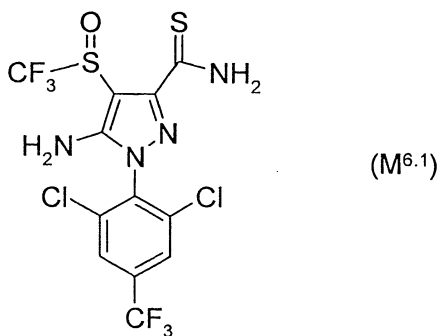
M.4.擬青少年激素：烯蟲乙酯(hydroprene)、烯蟲炔酯

(kinoprene)、美賜年(methoprene)、芬諾克(fenoxycarb)、百利普芬(pyriproxyfen)；

M.5. 菸鹼受體促效劑/拮抗劑化合物：啖蟲脒(acetamiprid)、免速達(bensultap)、殺螟丹氫氯酸鹽(cartap hydrochloride)、可尼丁(clothianidin)、呋蟲胺(dinotefuran)、益達胺(imidacloprid)、噻蟲嗪(thiamethoxam)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、菸鹼(nicotine)、賜諾殺(spinosad)(別位促效劑(allosteric agonist))、噻蟲啉(thiacloprid)、硫賜安(thiocyclam)、殺蟲雙(thiosultap-sodium)、式(M^{5.1})之噻唑化合物 AKD-1022



M.6. GABA門控氯離子通道拮抗劑化合物：可氯丹(chlordane)、硫丹(endosulfan)、 γ -HCH(gamma-HCH)(林丹(lindane))；醋蟲清(acetoprole)、乙蟲清(ethiprole)、氟蟲清(fipronil)、吡拉氟蟲清(pyrafluprole)、吡林蟲清(pyriprole)、伐林蟲清(vaniliprole)、式M^{6.1}之苯基吡啶化合物



M.7. 氯離子通道活化劑：阿巴丁(abamectin)、因滅汀苯甲酸酯(emamectin benzoate)、密滅汀(milbemectin)、來匹滅汀(lepimectin)；

M.8. METI I 化合物：喹蟎醚(fenazaquin)、芬普蟎(fenpyroximate)、畢汰芬(pyrimidifen)、噁蟎靈(pyridaben)、吡蟎胺(tebufenpyrad)、唑蟲醯胺(tolfenpyrad)、氟芬立莫(flufenerim)、魚藤酮(rotenone)；

M.9. METI II及III化合物：亞醯蟎(acequinocyl)、氟普令(fluacyprim)、海卓麥殺(hydramethylnon)；

M.10. 氧化磷酸化作用解偶聯劑：克凡派(chlorfenapyr)、DNOC；

M.11. 氧化磷酸化作用抑制劑：三唑錫(azocyclotin)、環己錫(cyhexatin)、汰芬隆(diafenthiuron)、芬布賜(fenbutatin oxide)、毆蟎多(propargite)、得脫蟎(tetradifon)；

M.12. 脫皮破裂劑：西洛美秦(cyromazine)、環蟲醯肼(chromafenozide)、氯醯肼(halofenozide)、甲氧蟲醯肼(methoxyfenozide)、得芬諾(tebufenozide)；

M.13. 增效劑：胡椒基丁醚(piperonyl butoxide)、脫葉磷(tribufos)；

M.14. 鈉通道阻斷劑化合物：因得克(indoxacarb)、美他氟宗(metaflumizone)；

M.15. 薰蒸劑：甲基溴、氯化苦硫醯氟(chloropicrin sulfuryl fluoride)；

M.16. 選擇性取食阻斷劑：克洛替(crylotie)、派滅淨(pymetrozine)、氟尼胺(flonicamid)；

M.17. 蟎生長抑制劑：克芬蟎(clofentezine)、合賽多(hexythiazox)、乙蟎唑(etoxazole)；

M.18. 甲殼素合成抑制劑：布芬淨(buprofezin)、雙三氟蟲脲(bistrifluron)、克福隆(chlorfluazuron)、二福隆(diflubenzuron)、氟環脲(flucycloxuron)、氟芬隆(flufenoxuron)、六伏隆(hexaflumuron)、祿芬隆(lufenuron)、諾華隆(novaluron)、紐伏隆(noviflumuron)、得福隆(teflubenzuron)、殺鈴脲(triflumuron)；

M.19. 脂質生物合成抑制劑：螺蟎酯(spirodiclofen)、斯必麥芬(spiromesifen)、螺四馬特(spirotetramat)；

M.20. 八巴胺能(octapaminergic)促效劑：雙甲脞(amitraz)；

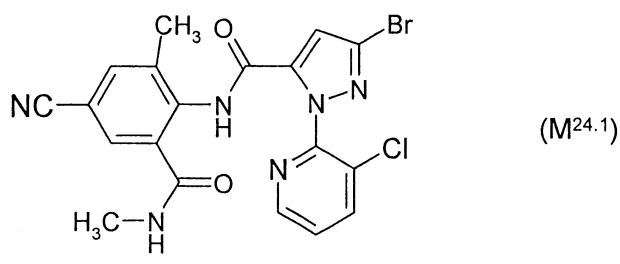
M.21. 理阿諾鹼(ryanodine)受體調節劑：表氟蟲醯胺(flubendiamide)；

M.22. 各種：磷化鋁、胺基氟米(amidoflumet)、苯氯噻西(benclothiaz)、苯蟎特(benzoximate)、聯苯肼酯(bifenazate)、硼砂(borax)、溴蟎酯(bromopropylate)、氰化物(cyanide)、賽諾吡拉芬(cyenopyrafen)、賽扶美托芬(cyflumetofen)、滅蟎猛(chinomethionate)、大克蟎(dicofol)、氟乙酸酯、磷化氫、啖蟲丙醚(pyridalyl)、比氟喹宗(pyrifluquinazon)、硫、吐酒石(tartar emetic)；

M.23. N-R'-2,2-二鹵基-1-R''環-丙烷甲醯胺-2-(2,6-二氯-

α, α, α -三氟-對甲苯基)脞或 $N-R'-2,2$ -二(R''')丙醯胺-2-(2,6-二氯- α, α, α -三氟-對甲苯基)-脞，其中 R' 為甲基或乙基，鹵基為氯基或溴基， R'' 為氫或甲基且 R''' 為甲基或乙基；

M.24. 鄰胺基苯甲醯胺類 (anthranilamides)：氯鄰胺基苯甲酸普 (chloranthraniliprole)、式 $M^{24.1}$ 之化合物



M.25. 丙二腈化合物： $CF_3(CH_2)_2C(CN)_2CH_2(CF_2)_3CF_2H$ 、 $CF_3(CH_2)_2C(CN)_2CH_2(CF_2)_5CF_2H$ 、 $CF_3(CH_2)_2C(CN)_2(CH_2)_2C(CF_3)_2F$ 、 $CF_3(CH_2)_2C(CN)_2(CH_2)_2(CF_2)_3CF_3$ 、 $CF_2H(CF_2)_3CH_2C(CN)_2CH_2(CF_2)_3CF_2H$ 、 $CF_3(CH_2)_2C(CN)_2CH_2(CF_2)_3CF_3$ 、 $CF_3(CF_2)_2CH_2C(CN)_2CH_2(CF_2)_3CF_2H$ 及 $CF_3CF_2CH_2C(CN)_2CH_2(CF_2)_3CF_2H$ ；

M.26. 微生物破裂劑：蘇雲金芽孢桿菌以色列亞種 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *Israelensi*)、球形芽孢桿菌 (*Bacillus sphaericus*)、蘇雲金芽孢桿菌亞莎華亞種 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *Aizawai*)、蘇雲金芽孢桿菌卻氏卡奇亞種 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *Kurstaki*)、蘇雲金芽孢桿菌擬步行蟲亞種 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *Tenebrionis*)；

群 M 之市售化合物可見於其他公開案中之 The Pesticide Manual，第 13 版，British Crop Protection Council(2003)。

WO 98/28279 描述式 M^{6.1} 之硫代醯胺及其製備。自 Agro Project, PJB Publications Ltd, 2004 年 11 月已知來匹滅汀。EP-A1 454621 中描述苯氣噻西及其製備。Farm Chemicals Handbook, 第 88 卷, Meister Publishing Company, 2001 中描述殺撲磷及對氧磷(Paraoxon)及其製備。WO 98/28277 中描述醋蟲清及其製備。EP-A1 462 456 中描述美他氟宗及其製備。Pesticide Science 54, 1988, 第 237-243 頁及 US 4822779 中描述吡氟硫磷(Flupyrzofos)。JP 2002193709 中及 WO 01/00614 中描述吡拉氟蟲清及其製備。WO 98/45274 中及 US 6335357 中描述吡林蟲清及其製備。US 6221890 中及 JP 21010907 中描述胺基氟米及其製備。WO 03/007717 中及 WO 03/007718 中描述氟芬立莫及其製備。

Zhang, A. 等人於 J. Neurochemistry, 75(3), 2000 中描述與 AKD-1022(M^{5.1}) 類似之新菸鹼類似物(neonicotimid)之製備方法。WO 01/70671、WO 02/48137、WO 03/24222、WO 03/15518、WO 04/67528、WO 04/33468 及 WO 05/118552 中描述與式 M^{24.1} 類似之氯鄰胺基苯甲酸普及鄰胺基苯甲醯胺衍生物及其製備。WO 04/080180 中描述賽扶美托芬及其製備。EP A 109 7932 中描述胺基喹啉酮化合物比氟喹宗。WO 05/63694 中描述丙二腈化合物
 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ 、 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_5\text{CF}_2\text{H}$ 、
 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{F}$ 、 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ 、
 $\text{CF}_2\text{H}(\text{CF}_2)_3\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ 、
 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ 、

$\text{CF}_3(\text{CF}_2)_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ ；及

$\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ 。

殺真菌混合搭配物為選自由下列物質組成之群F者：

F.1 醯基丙胺酸類，諸如本達樂 (benalaxyl)、滅達樂 (metalaxyl)、呋醯胺 (ofurace)、毆殺斯 (oxadixyl)；

F.2 胺衍生物，諸如阿迪莫夫 (aldimorph)、多寧 (dodine)、嗎菌靈 (dodemorph)、芬普福 (fenpropimorph)、苯鏽啉 (fenpropidin)、雙胍鹽 (guazatine)、雙胍辛胺 (iminooctadine)、螺噁胺 (spiroxamin)、三得芬 (tridemorph)；

F.3 苯胺嘧啶類 (anilinopyrimidine)，諸如派美尼 (pyrimethanil)、滅派林 (mepanipyrim) 或賽普洛 (cyrodinyl)；

F.4 抗生素類，諸如環己醯亞胺 (cycloheximid)、灰黃黴素 (griseofulvin)、春日黴素 (kasugamycin)、遊黴素 (natamycin)、多氧菌素 (polyoxin) 或鏈黴素 (streptomycin)；

F.5 唑類，諸如比多農 (bitertanol)、溴克唑 (bromoconazole)、環克座 (cyproconazole)、地芬康唑 (difenoconazole)、二硝克座 (dinitroconazole)、環氧康唑 (epoxiconazole)、芬布康唑 (fenbuconazole)、氟喹克唑 (fluquiconazole)、護矽得 (flusilazole)、六康唑 (hexaconazole)、依滅列 (imazalil)、葉菌唑 (metconazole)、邁克尼 (myclobutanil)、平克唑

(penconazole) 、 普 克 利 (propiconazole) 、 撲 克 拉 (prochloraz) 、 普 硫 康 唑 (prothioconazole) 、 得 克 利 (tebuconazole) 、 三 泰 芬 (triadimefon) 、 三 泰 隆 (triadimenol) 、 三 氟 米 唑 (triflumizol) 、 環 菌 唑 (triticonazole) 、 護 汰 芬 (flutriafol) ；

F.6 二 羧 甲 鹽 亞 胺 類 ， 諸 如 依 普 同 (iprodion) 、 米 克 啞 (myclozolin) 、 撲 滅 寧 (procymidon) 、 免 克 寧 (vinclozolin) ；

F.7 二 硫 代 胺 基 甲 酸 酯 類 ， 諸 如 富 爾 邦 (ferbam) 、 納 邦 (nabam) 、 錳 乃 浦 (maneb) 、 錳 粉 克 (mancozeb) 、 威 百 畝 (metam) 、 免 得 爛 (metiram) 、 甲 基 鋅 乃 浦 (propineb) 、 聚 胺 基 甲 酸 酯 (polycarbamate) 、 得 恩 地 (thiram) 、 益 穗 (ziram) 、 鋅 乃 浦 (zineb) ；

F.8 雜 環 化 合 物 ， 諸 如 敵 菌 靈 (anilazine) 、 免 賴 得 (benomyl) 、 博 克 利 (boscalid) 、 貝 芬 替 (carbendazim) 、 萎 鏽 靈 (carboxin) 、 氧 化 萎 鏽 靈 (oxycarboxin) 、 賽 座 滅 (cyazofamid) 、 邁 隆 (dazomet) 、 腈 硫 醌 (dithianon) 、 凡 殺 同 (famoxadon) 、 苯 胺 唑 酮 (fenamidon) 、 芬 瑞 莫 (芬 瑞 莫) 、 麥 穗 靈 (fuberidazole) 、 氟 多 寧 (flutolanil) 、 福 拉 比 (furametpyr) 、 亞 賜 圃 (isoprothiolane) 、 滅 普 寧 (mepronil) 、 尼 瑞 莫 (nuarimol) 、 撲 殺 熱 (probenazole) 、 普 奎 那 茲 (proquinazid) 、 比 利 芬 羅 (pyrifenox) 、 百 快 隆 (pyroquilon) 、 快 諾 芬 (quinoxifen) 、 矽 硫 芬 (silthiofam) 、 噻 苯 達 唑 (thiabendazole) 、 賽 氟 滅 (thifluzamid) 、 甲 基 - 多

保淨 (thiophanate-methyl)、汰敵寧 (tiadinil)、三賽唑 (tricyclazole)、賽福寧 (triforine)；

F.9銅殺真菌劑，諸如鋅錳波爾多 (Bordeaux)混合物、乙酸銅、鹼性氯氧化銅、鹼性硫酸銅；

F.10硝基苯基衍生物，諸如百蟎克 (binapacryl)、白粉克 (dinocap)、大脫蟎 (dinobuton)、硝基鄰苯二甲酸異丙基；

F.11苯基吡咯類，諸如拌種咯 (fenpiclonil)或護汰寧 (fludioxonil)；

F.12嗜毬果傘素 (strobilurin)，諸如亞托敏 (azoxystrobin)、地莫菌胺 (dimoxystrobin)、氟氧菌胺 (fluoxastrobin)、克收欣 (kresoxim-methyl)、苯氧菌胺 (metominostrobin)、奧瑞菌胺 (orysastrobin)、啖氧菌酯 (picoxystrobin)或三氟敏 (trifloxystrobin)；

F.13次磺酸衍生物，諸如四氯丹 (captafol)、蓋普丹 (captan)、益發靈 (dichlofluanid)、福爾培 (folpet)、益洛寧 (tolylfluanid)；

F.14肉桂醯胺類及類似物，諸如達滅芬 (dimethomorph)、氟美醯胺 (flumetover)或氟嗎啉 (flumorph)；

F.15硫及其他殺真菌劑類，諸如酸化苯并噻二唑-S-甲酯 (acibenzolar-S-methyl)、苯噻瓦利 (benthiavalicarb)、加普胺 (carpropamid)、四氯異苯腈 (chlorothalonil)、噻芬胺 (cyflufenamid)、霜脲氰 (cymoxanil)、邁隆、噻菌清 (diclomezin)、二氯西莫 (diclocymet)、乙微威 (diethofencarb)、護粒松 (edifenphos)、乙噻博胺

(ethaboxam)、環鹽菌胺(fenhexamid)、三苯醋錫(fentin-acetate)、禾草靈(fenoxanil)、噁菌腓(ferimzone)、扶吉胺(fluazinam)、福賽得、福賽得鋁(fosetyl-aluminum)、顯徽威(iprovalicarb)、六氯苯、美曲芬諾(metrafenon)、賓克隆(pencycuron)、霜徽威(propamocarb)、苯酞(phthalide)、脫克松(tolclofos-methyl)、奎脫辛(quintozene)、唑沙麥(zoxamid)。

應用

可藉由使用此項技術中已知之任何應用方法使動物害蟲(亦即昆蟲類、蜘蛛類節肢動物及線蟲類)、植物、植物生長於其中之土壤或水與本發明化合物I或含有本發明化合物I之組合物接觸。如此，"接觸"包括直接接觸(將化合物/組合物直接應用於動物害蟲或植物上-通常應用於植物葉、莖或根上)及間接接觸(將化合物/組合物應用於動物害蟲或植物所在地)。

可藉由使植物/作物與殺害蟲有效量之式I化合物接觸將式I化合物或包含其之殺害蟲組合物用於保護生長植物及作物免受動物害蟲(尤其為昆蟲、粉蟎科或蜘蛛類節肢動物)之攻擊或侵襲。術語"作物"係指生長作物及已收穫作物。

此外，可藉由使目標害蟲、其食物供應、棲所、繁殖區域或其所在地與殺害蟲有效量之式I化合物接觸來防治動物害蟲。如此，可在害蟲侵襲所在地、生長作物或已收穫作物之前或之後進行應用。

亦可預防性地將本發明之化合物應用於預期害蟲將出現之場所。

亦可藉由使植物與殺害蟲有效量之式I化合物接觸將式I化合物用於保護生長植物免受害蟲攻擊或侵襲。如此，"接觸"包括直接接觸(將化合物/組合物直接應用於害蟲及/或植物上-通常應用於植物葉、莖或根上)及間接接觸(將化合物/組合物應用於害蟲及/或植物所在地)。

"所在地"意謂害蟲或寄生蟲生長或可生長之棲所、繁殖區域、植物、種子、土壤、區域、材料或環境。

"殺害蟲有效量"通常意謂達成對生長之可觀測作用(包括壞死、死亡、延遲、預防及移除、破壞或另外減少目標有機物發生及活性之作用)所需之活性成份之量。本發明中所用之不同化合物/組合物之殺害蟲有效量可變化。組合物之殺害蟲有效量亦可根據盛行條件(諸如所要殺害蟲作用及持續時間、天氣、目標物種、所在地、應用模式及其類似情況)而變化。

在土壤處理或應用於害蟲住所或巢穴之情況下，活性成份之量在每100平方公尺0.0001至500 g範圍內，較佳在每100平方公尺0.001至20 g範圍內。

在保護材料時，慣常應用率為(例如)每平方公尺受處理材料0.01 g至1000 g活性化合物，理想地每平方公尺0.1 g至50 g。

用於浸漬材料之殺昆蟲組合物通常含有0.001至95重量%，較佳0.1至45重量%，且更佳1至25%之至少一種拒避劑

及/或殺昆蟲劑。

為用於處理作物，本發明之活性成份之應用率可在每公頃 0.1 g 至 4000 g，理想地每公頃 25 g 至 600 g，更理想地每公頃 50 g 至 500 g 範圍內。

式 I 化合物經接觸(經土壤、玻璃、牆壁、蚊帳、地毯、植物部分、動物部分)及攝取(誘餌或植物部分)而有效。

本發明之化合物亦可應用於抵抗非作物蟲害，諸如螞蟥、白蟻、黃蜂、蒼蠅、蚊子、蟋蟀或蟑螂。為用於抵抗該等非作物害蟲，較佳在誘餌組合物中使用式 I 化合物。

誘餌可為液體、固體或半固體製劑(例如凝膠)。固體誘餌可成形為適於各別應用之不同形狀及形式，例如顆粒、塊狀物、棒狀物、盤狀物。液體誘餌可填充於不同裝置中以確保適當應用，例如開口容器、噴霧裝置、小液滴源或蒸發源。凝膠可以水性或油狀基質為主，且可根據黏性、保水性或老化特徵調配為特別必需品。

組合物中所採用之誘餌為具有足夠吸引力以刺激諸如螞蟥、白蟻、黃蜂、蒼蠅、蚊子、蟋蟀等或蟑螂之昆蟲食用其之產品。可藉由使用取食刺激劑或性信息素操縱吸引力。食物刺激劑係選自(例如，但並非唯一地)動物及/或植物蛋白(肉粉、魚粉或血粉、昆蟲部分、蛋黃)、選自動物及/或植物源之脂肪及油，或單有機醣、寡有機醣或多有機醣，尤其選自蔗糖、乳糖、果糖、右旋糖、葡萄糖、澱粉、果膠或甚至糖蜜或蜂蜜。水果、作物、植物、動物、昆蟲或其特定部分之新鮮或腐爛部分亦可充當取食刺激

劑。已知性信息素更具昆蟲專一性。專一性信息素描述於文獻中且為熟習此項技術者已知。

為用於誘餌組合物，活性成份之典型含量為活性化合物之0.001重量%至15重量%，理想地0.001重量%至5%重量%。

呈氣溶膠(例如於噴霧罐中)、油噴霧劑或泵噴霧劑形式之式I化合物之調配物極適於非專業使用者來防治諸如蒼蠅、跳蚤、壁虱、蚊子或蟑螂之害蟲。氣溶膠配方較佳由以下物質構成：活性化合物、諸如低級醇(例如甲醇、乙醇、丙醇、丁醇)之溶劑、酮類(例如丙酮、甲基乙基酮)、具有約50至250°C之沸騰範圍之石蠟烴(例如煤油)、二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯啉酮、二甲亞砷、芳族烴(諸如甲苯、二甲苯)、水，此外為助劑，諸如乳化劑(諸如山梨糖醇單油酸酯、具有3-7 mol環氧乙烷之乙氧基化油烯、乙氧基化脂肪醇)、香料油(諸如香精油、中級脂肪酸與低級醇之酯、芳族羰基化合物)、若適當之穩定劑(諸如苯甲酸鈉、兩性界面活性劑、低碳環氧化物、原甲酸三乙酯)及(若需要)推進劑(諸如丙烷、丁烷、氮氣、壓縮空氣、二甲醚、二氧化碳、氧化亞氮或此等氣體之混合物)。

油噴霧調配物不同於氣溶膠配方，因為其未使用推進劑。

為用於噴霧組合物，活性成份之含量為0.001至80重量%，較佳為0.01至50重量%且最佳為0.01至15重量%。

式I化合物及其各別組合物亦可用於蚊香及熏香、煙霧

筒、蒸發器盤或長期蒸發器且亦用於蛀蟲紙、蛀蟲墊或其他與熱無關之蒸發器系統。

以式I化合物及其各別組合物防治昆蟲傳播之侵襲性疾病(例如瘧疾、登革熱及黃熱病、淋巴絲蟲病及利什曼體病(leishmaniasis))之方法亦包含處理小屋及房屋表面、空氣噴霧及浸漬窗簾、帳篷、衣服項目、蚊帳、捕舌蠅器或其類似物。應用於纖維、織品、針織品、非編織物、網材料或箔及防水油布之殺昆蟲組合物較佳包含包括殺昆蟲劑、視情況之拒避劑及至少一種黏合劑之混合物。舉例而言，合適拒避劑為N,N-二乙基-間甲苯醯胺(DEET)、N,N-二乙基苯基乙醯胺(DEPA)、1-(3-環己-1-基-羰基)-2-甲基胡椒鹼、(2-羥基甲基環己基)乙酸內酯、2-乙基-1,3-己二醇、避蚊酮(indalone)、甲基新癸醯胺(MNDA)、不用於防治昆蟲之擬除蟲菊酯(諸如{(+/-)-3-烯丙基-2-甲基-4-側氧基環戊-2-(+)-烯基-(+)-反-菊酸酯(賜百寧, Esbiothrin))、衍生於植物萃取物或與植物萃取物一致之拒避劑(如檸檬烯、丁香酚、(+)-Eucamalol (1)、(-)-1-表-eucamalol)或來自例如斑皮桉(*Eucalyptus maculata*)、蔓荊(*Vitex rotundifolia*)、玫瑰草(*Cymbopogon martinii*)、檸檬草(*Cymbopogon citratus*, lemon grass)、香茅(*Cymbopogon nardus*, citronella)的植物之粗植物萃取物。合適黏合劑係選自(例如)脂族酸之乙烯酯(諸如乙酸乙烯酯及維吾爾酸乙烯酯)、醇類之丙烯酸及甲基丙烯酸酯(諸如丙烯酸丁酯、2-乙基己基丙烯酸酯及丙烯酸甲酯)、單及二烯系不飽和烴

(諸如苯乙烯)及脂族二烯(諸如丁二烯)之聚合物及共聚物。

通常藉由將紡織品材料浸入殺昆蟲劑之乳液或懸浮液中或將其噴霧於網狀物上來浸漬窗簾及蚊帳。

式I化合物及其組合物可用於保護諸如樹木、木柵欄、枕木等之木製材料及諸如房屋、外屋、工廠之建築物，且亦可用於保護建築材料、傢具、皮革、纖維、乙烯基物品、電線及電纜等免受螞蟻及/或白蟻侵害，且用於防治螞蟻及白蟻免於傷害作物或人類(例如當害蟲侵入房屋及公共設施時)。式I化合物不僅應用於周圍土壤表面或地板下土壤中以保護木製材料，且其亦可應用於木材物品，諸如地板下混凝土、壁櫥柱、橫樑、夾板、傢具等之表面；木製物品，諸如粒子板、半板等；及乙烯基物品，諸如經塗佈電線、乙烯基薄片、諸如苯乙烯泡沫之絕熱材料等。在應用於抵抗螞蟻傷害作物或人類之情況下，將本發明之螞蟻防治器應用於作物或周圍土壤，或直接應用於螞蟻巢穴或其類似物。

種子處理

式I化合物亦適於處理種子以保護種子免受蟲害，詳言之免受土生蟲害且保護所得植物的根及幼芽抵抗土壤害蟲及葉昆蟲。

式I化合物尤其可用於保護種子免受土壤害蟲且保護所得植物的根及幼芽抵抗土壤害蟲及葉昆蟲。較佳保護所得植物的根及幼芽。更佳保護所得植物之幼芽免受刺式及吸

式昆蟲侵害，其中最佳保護免受蚜蟲侵害。

因此，本發明包含一種用於保護種子免受昆蟲侵害，詳言之免受土壤昆蟲侵害及保護幼苗的根及幼芽免受昆蟲侵害，詳言之免受土壤及葉昆蟲侵害之方法，該方法包含在播種之前及/或催芽之後使種子與通式I之化合物或其鹽接觸。尤其較佳為一種保護植物的根及幼苗之方法，更佳為一種保護植物根免受刺式及吸式昆蟲侵害之方法，最佳為一種保護植物幼芽免受蚜蟲侵害之方法。

術語種子涵蓋所有種類之種子及植物繁殖體，包括(但不限於)真種子、插條、吸芽、球莖、鱗莖、果實、塊莖、穀粒、插枝、伐條及其類似物，且在較佳實施例中意謂真種子。

術語種子處理包含此項技術中已知之所有合適種子處理技術，諸如種子包衣、種子塗佈、種子噴粉、種子浸泡及種子粒化。

本發明亦包含以活性化合物塗佈之種子或含有活性化合物之種子。

術語"以...塗佈及/或含有..."通常表示儘管視應用方法而定，或多或少部分之成份可滲透至繁殖產物中，但在應用時活性成份大部分處於繁殖產物之表面上。當種植/重新種植該繁殖產物時，其可吸收活性成份。

合適種子為穀類、塊根作物、油料作物、蔬菜、香料、觀賞植物之種子，例如硬質小麥及其他小麥、大麥、燕麥、裸麥、玉米(飼料玉米及糖玉米/甜玉米及大田玉米)、

大豆、油料作物、十字花科植物、棉花、向日葵、香蕉、水稻、油籽油菜、蕪菁油菜、甜菜、飼料甜菜、茄子、馬鈴薯、草、草坪、草皮、飼料牧草、番茄、韭菜、南瓜(pumpkin/squash)、甘藍菜、卷心莴苣、胡椒、黃瓜、甜瓜、芸苔(Brassica)種、甜瓜、豆、豌豆、大蒜、洋蔥、胡蘿蔔、諸如馬鈴薯之塊莖植物、甘蔗、煙草、葡萄、矮牽牛屬、天竺葵/天竺葵屬、三色堇及鳳仙花屬之種子。

此外，活性化合物亦可用於處理來自由於育種(包括基因工程方法)而忍受除草劑或殺真菌劑或殺昆蟲劑作用之植物之種子。

舉例而言，活性化合物可用於處理來自對來自由磺胺脲類、咪唑啉酮類、草銨膦(glufosinate-ammonium)或草甘膦異丙胺鹽(glyphosate-isopropylammonium)及類似活性物質組成之群的除草劑具有抵抗性之植物之種子(例如，見EP-A-0242236、EP-A-242246)(WO 92/00377)(EP-A-0257993、美國專利第5,013,659號)，或者可用於可產生蘇雲金芽孢桿菌毒素(Bacillus thuringiensis toxin)(Bt毒素)且從而使植物對一些害蟲具有抵抗性之轉殖基因作物(例如棉花)(EP-A-0142924, EP-A-0193259)。

此外，活性化合物亦可用於處理來自與現有植物相比具有經改進特徵之植物之種子，該等植物可(例如)藉由傳統育種方法及/或突變體之產生或藉由重組程序而產生。舉例而言，已描述大量為達成改質植物中所合成之澱粉之目的而對作物進行重組改質(例如 WO 92/11376、WO

92/14827、WO 91/19806)或具有經改質脂肪酸組份之轉殖基因作物(WO 91/13972)之情況。

在植物播種之前且在植物發芽之前，藉由噴霧或藉由種子噴粉進行活性化合物之種子處理應用。

尤其可用於種子處理之組合物為(例如)：

A.可溶濃縮物(SL，LS)

D.乳液(EW，EO，ES)

E.懸浮液(SC，OD，FS)

F.水分散性顆粒及水溶性顆粒(WG，SG)

G.水分散性粉末及水溶性粉末(WP，SP，WS)

H.凝膠調配物(GF)

I.可噴粉之粉末(DP，DS)

習知種子處理調配物包括(例如)可流動濃縮物FS、溶液LS、用於乾燥處理之粉末DS、用於漿料處理之水分散性粉末WS、水溶性粉末SS及乳液ES及EC及凝膠調配物GF。此等調配物可經稀釋或不經稀釋而應用於種子。應用於種子可在播種前直接應用於種子上或在將種子催芽後進行。

在一較佳實施例中，將FS調配物用於種子處理。FS調配物通常可包含1至800 g/l之活性成份、1至200 g/l之界面活性劑、0至200 g/l之防凍劑、0至400 g/l之黏合劑、0至200 g/l之顏料及至多1公升較佳為水之溶劑。

用於種子處理之式I化合物之尤其較佳FS調配物通常包含0.1至80重量%(1至800 g/l)之活性成份、0.1至20重量%(1至200 g/l)之至少一種界面活性劑(例如0.05至5重量%之濕

潤劑及0.5至15重量%之分散劑)、至多20重量%(例如5至20%)之防凍劑、0至15重量%(例如1至15重量%)之顏料及/或染料、0至40重量%(例如1至40重量%)之黏合劑(黏著劑/膠黏劑)、視情況為至多5重量%(例如0.1至5重量%)之增稠劑、視情況為0.1至2%之消泡劑及視情況(例如)為0.01至1重量%之量之防腐劑(諸如殺生物劑、抗氧化劑或其類似物)及至多100重量%之填充劑/媒劑。

種子處理調配物亦可額外包含黏合劑及視情況之著色劑。

可添加黏合劑以改良處理後活性材料黏著於種子上之黏著力。合適黏合劑為來自例如環氧乙烷或環氧丙烷之環氧烷類之均聚物及共聚物、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇類、聚乙烯吡咯啉酮類及其共聚物、乙烯-乙酸乙烯酯共聚物、丙烯酸均聚物及共聚物、聚乙烯胺(polyethyleneamine)、聚乙烯醯胺(polyethyleneamide)及聚乙烯亞胺、例如纖維素、甲基纖維素及澱粉之多醣、例如石蠟/順丁烯二酸酐共聚物之聚烯烴均聚物及共聚物、聚胺基甲酸酯、聚酯、聚苯乙烯均聚物及共聚物。

調配物中視情況亦可包括著色劑。適於種子處理調配物之著色劑或染料為諾丹明B、C.I.顏料紅112、C.I.溶劑紅1、顏料藍15:4、顏料藍15:3、顏料藍15:2、顏料藍15:1、顏料藍80、顏料黃1、顏料黃13、顏料紅112、顏料紅48:2、顏料紅48:1、顏料紅57:1、顏料紅53:1、顏料橘黃43、顏料橘黃34、顏料橘黃5、顏料綠36、顏料綠7、顏料

白 6、顏料棕 25、鹼性紫 10、鹼性紫 49、酸性紅 51、酸性紅 52、酸性紅 14、酸性藍 9、酸性黃 23、鹼性紅 10、鹼性紅 108。

膠凝劑之實例為角叉菜(carrageen)(Satiagel[®])。

在種子處理中，化合物 I 之應用率通常為每 100 公斤種子 0.1 g 至 10 kg，較佳為每 100 公斤種子 1 g 至 5 kg，更佳為每 100 公斤種子 1 g 至 1000 g，且詳言之為每 100 公斤種子 1 g 至 200 g。

因此，本發明亦係關於包含如本文所定義之式 I 化合物或 I 之農業上有用之鹽之種子。化合物 I 或其農業上有用之鹽之量通常自每 100 公斤種子 0.1 g 變化至 10 kg，較佳自每 100 公斤種子 1 g 變化至 5 kg，詳言之自每 100 kg 種子 1 g 變化至 1000 g。對於諸如萬苳之特定作物，比率可更高。

現將藉由下列實例進一步詳述本發明。

在下表 C 中，一些較佳化合物實例將藉由其物理資料表徵。

表 C：

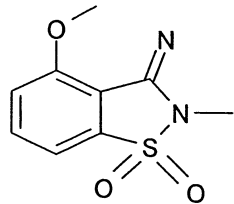
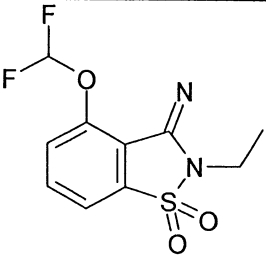
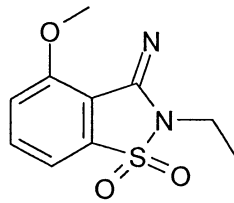
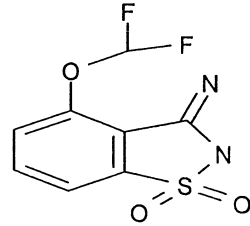
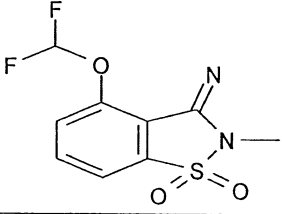
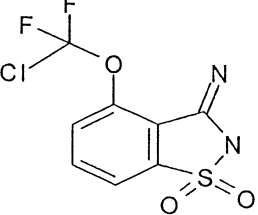
藉由偶合高效液相層析法/質譜法(HPLC/MS)、NMR 或其熔點來表徵產物。

分析型 HPLC 管柱：RP-18 管柱 Chromolith Speed ROD，來自 Merck KGaA, Germany。溶離：比率為 5:95 至 95:5 之乙腈 + 0.1% 三氟乙酸(TFA)/水 + 0.1% 三氟乙酸(TFA)，在 5 分鐘內，在 40℃ 下。

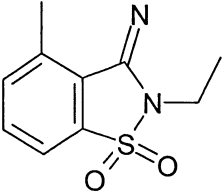
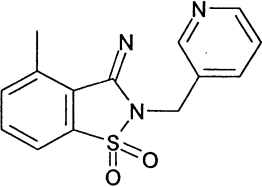
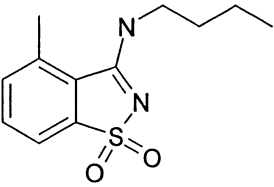
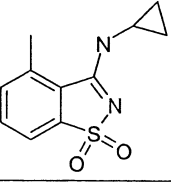
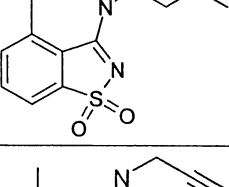
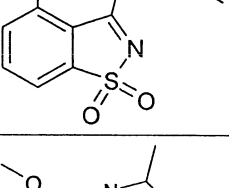
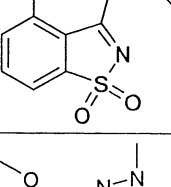
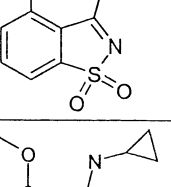
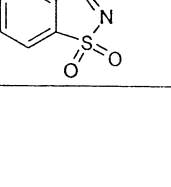
一些化合物由 ¹H-NMR 表徵。藉由相對於四甲基矽烷之

化學位移(ppm)、其多樣性及其積分(所給定之相對氫原子數)表徵信號。下列縮寫用於表徵信號之多樣性。M=多重峰，q=四重峰，t=三重峰，d=雙重峰且s=單峰。

表 C：

化合物 n°	結構	物理資料：T _{mp} (熔點)，以 [°C]表示或 HPLC-MS (t _r 滯留時間；M/Z) 或 ¹ H-NMR
C.1		T _{mp} =129-137
C.2		T _{mp} =97-100
C.3		T _{mp} =111-114
C.4		T _{mp} =202-208
C.5		T _{mp} =75-86
C.6		¹ H-NMR [DMSO-d ₆]: δ 以 ppm 表示: 7.81 (d, 1H), 8.01 (m, 2H), 9.26 (bs, 2H)

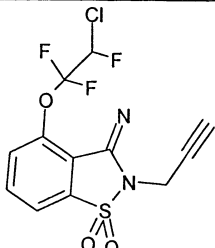
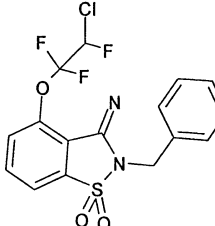
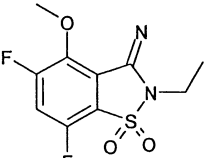
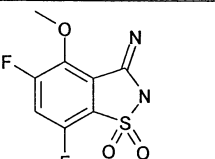
化合物 n°	結構	物理資料：T _{mp} (熔點)，以 [°C]表示或 HPLC-MS (t _r 滯留時間；M/Z) 或 ¹ H-NMR
C.7		T _{mp} =208-210
C.8		¹ H-NMR [CDCl ₃]: δ 以 ppm 表示: 3.30 (s, 3H), 6.44 (dt, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.84 (m, 2H)
C.9		T _{mp} =116-120
C.10		油
C.11		T _{mp} =148-156
C.12		T _{mp} =183-191
C.13		T _{mp} =217-222

化合物 n°	結構	物理資料：T _{mp} (熔點)，以 [°C]表示或 HPLC-MS (t _r 滯留時間；M/Z) 或 ¹ H-NMR
C.14		T _{mp} =110-113
C.15		T _{mp} =203-206
C.16		HPLC-MS: t _r =2.52 min; M/Z=253 (M+1)
C.17		T _{mp} =218-220
C.18		HPLC-MS: t _r =1.93 min; M/Z=255 (M+1)
C.19		HPLC-MS: t _r =1.92 min; M/Z=235 (M+1)
C.20		HPLC-MS: t _r =2.12 min; M/Z=255 (M+1)
C.21		HPLC-MS: t _r =1.44 min; M/Z=242 (M+1)
C.22		HPLC-MS: t _r =1.92 min; M/Z=253 (M+1)

化合物 n°	結構	物理資料：T _{mp} (熔點)，以 [°C]表示或 HPLC-MS (t _r 滯留時間；M/Z) 或 ¹ H-NMR
C.23		HPLC-MS: t _r =1.86 min; M/Z=251 (M+1)
C.24		HPLC-MS: t _r =2.25 min; M/Z=289 (M+1)
C.25		T _{mp} =69-75
C.26		HPLC-MS: t _r =2.65 min; M/Z=291 (M+1)
C.27		T _{mp} =219-224
C.28		T _{mp} =133-134
C.29		T _{mp} =139-141
C.30		T _{mp} =224-225

化合物 n°	結構	物理資料：T _{mp} (熔點)，以 [°C]表示或 HPLC-MS (t _r 滯留時間；M/Z) 或 ¹ H-NMR
C.31		¹ H-NMR [CDCl ₃]: δ 以 ppm 表示: 1.33 (t, 3H), 3.57 (q, 2H), 4.01 (s, 3H), 6.30 (bs, 1H), 6.67 (d, 1H), 7.28 (d, 1H), 7.32 (t, 1H)
C.32		T _{mp} =65-67
C.33		T _{mp} =64-70
C.34		HPLC-MS: t _r =1.75 min; M/Z=225 (M+1)
C.35		T _{mp} =136-140
C.36		¹ H-NMR [d ₆ -DMSO]: δ 以 ppm 表示: 3.25 (s, 3 H), 4.05 (s, 3 H), 7.20 (dd, 1 H), 7.35 (m, 1 H), 8.95 (Br s, 1 H).
C.37		¹ H-NMR [d ₆ -DMSO]: δ 以 ppm 表示: 3.98 (s, 3 H), 7.45 (m, 1 H), 7.67 (t, 1 H), 8.05 (br s, 1 H), 9.25 (br s, 1 H)
C.38		T _{mp} =109-120
C.39		T _{mp} =93-103

化合物 n°	結構	物理資料：T _{mp} (熔點)，以 [°C]表示或 HPLC-MS (t _r 滯留時間；M/Z) 或 ¹ H-NMR
C.40		T _{mp} =175-176
C.41		HPLC-MS: t _r =2.10 min; M/Z=259 (M+1)
C.42		T _{mp} =182-187
C.43		HPLC-MS: t _r =3.39 min; M/Z=259 (M+1)
C.44		T _{mp} =268-270
C.45		T _{mp} =223-225
C.46		T _{mp} =198-200

化合物 n°	結構	物理資料：T _{mp} (熔點)，以 [°C]表示或 HPLC-MS (t _r 滯留時間；M/Z) 或 ¹ H-NMR
C.47		¹ H NMR (於 CDCl ₃ 中): δ [ppm]=2.36 (s, 1H), 4.60 (s, 2H), 6.42 (m, 1H), 7.71 (m, 1H), 7.82 (m, 2H), 9.09 (bs, 1H)
C.48		¹ H NMR (於 CDCl ₃ 中): δ [ppm]=4.99 (s, 2H), 6.41 (m, 1H), 7.30 (m, 3H), 7.52 (m, 2H), 7.69 (m, 1H), 7.83 (m, 2H), 8.92 (bs, 1H)
C.49		HPLC-MS: t _r =1.77 min; M/Z=277 (M+1)
C.50		T _{mp} =220-224

合成實例

S.1. 2-乙基-4-甲氧基-1,1-二側氧基-1,2-二氫-1λ*6*-苯并[d]異噻唑-3-亞基胺(化合物實例 C.3)

將 1.50 g (6.24 mmol) 2-氟基-N-乙基-3-甲氧基-苯磺醯胺添加至 2.59 g (18.7 mmol) 碳酸鉀於 15 ml 1,4-二噁烷與 6 ml 水之混合物中之溶液中。在室溫下將溶液攪拌 24 h。藉由添加 10% HCl (pH=7) 來中和溶液。將溶液以乙酸乙酯萃取 2 次。將有機層經 Na₂SO₄ 乾燥且濃縮。將仍含有起始材料之粗產物溶解於乙酸乙酯與 10% HCl 之混合物中且猛烈震盪。分離各層且藉由添加碳酸氫鈉中和水層。將水層以乙酸乙酯萃取 2 次。將有機層經 Na₂SO₄ 乾燥且濃縮以產生 830

mg(3.45 mmol)熔點(T_{mp})為111-114°C之標題化合物。

S.2. 4-甲基-1,1-二側氧基-1H-1λ*6*-苯并[d]異噻唑-3-基)-丙-2-炔基-胺(化合物實例C.19)：

步驟1：2-氰基-N-二乙氧基亞甲基-3-甲基-苯磺醯胺之合成

在自混合物中移除乙醇之情形下，在攪拌下將3.60 g(18.4 mmol)2-氰基-3-甲基-苯磺醯胺及5.29 g四乙氧基甲烷(27.5 mmol)緩慢加熱至160°C。使混合物冷卻至室溫。將殘餘物以汽油醚digerate、過濾且乾燥以提供4.91 g(理論值之90%)2-氰基-N-二乙氧基亞甲基-3-甲基-苯-磺醯胺。

步驟2：4-甲基-1,1-二側氧基-1H-1λ*6*-苯并[d]異噻唑-3-基)-丙-2-炔基-胺(C.19)之合成

經4 h將500 mg(1.69 mmol)2-氰基-N-二乙氧基亞甲基-3-甲基-苯磺醯胺及930 mg(16.9 mmol)炔丙胺加熱至70°C。在真空中移除所有揮發物。將殘餘物以二氯甲烷digerated以獲得246 mg(1.05 mmol;理論值之62%)標題化合物(C.19)。

S.3. (4-二氟甲氧基-1,1-二側氧基-1H-1λ*6*-苯并[d]異噻唑-3-基)-異丙胺(化合物實例C.26)

將400 mg(1.5 mmol)3-氯-4-二氟甲氧基-苯并[d]異噻唑1,1-二氧化物溶解於5 ml無水THF中且冷卻至0°C。將883 mg(15.0 mmol)異丙胺溶解於5 ml無水THF中且緩慢添加。在此溫度下持續攪拌1 h，且在室溫下持續攪拌14 h。在真空中濃縮混合物。在二氧化矽(溶離劑：環己烷/乙酸乙酯

4:1)上純化殘餘物以提供 140 mg(0.48 mmol; 理論值之 32%)
標題化合物(C.26)。

S.4 (4-甲氧基-苯并[d]異噻唑-3-基)-甲胺(化合物實例 C.32)

步驟 1：2-氰基-3-甲氧基-苯硫醇鈉之合成

在室溫下將 15.5 g(93.8 mmol)4-甲氧基-苯并[d]異噻唑溶解於 200 ml 乙二醇二甲醚中。添加 10.45 g(188 mmol)甲氧化鈉。經 8 h 將混合物加熱至 80°C 且在室溫下持續攪拌 16 h。將混合物分開且四分之一之混合物未經進一步純化即用於隨後合成。

步驟 2：(4-甲氧基-苯并[d]異噻唑-3-基)-甲胺(C.32)之合成

將 THF 中之 55 g(704 mmol)甲胺添加至先前反應之反應混合物中。使混合物冷卻至 0°C。緩慢添加 34.9 g(23.5 mmol)5% NaOCl 溶液。在溫至室溫下將混合物攪拌隔夜。將反應混合物傾入水中。以乙酸乙酯萃取混合物。使有機層經 Na₂SO₄ 乾燥且濃縮。在二氧化矽(溶離劑：環己烷/乙酸乙酯)上純化粗產物以產生 3.04 g(15.7 mmol)呈褐色油狀物之標題化合物。

S.5 乙基-(4-甲氧基-1-側氧基-1H-1λ⁴-苯并[d]異噻唑-3-基)-胺(化合物實例 C.34)

將 90 mg(0.43 mmol)與化合物實例 32 類似地製備之乙基-(4-甲氧基-苯并[d]異噻唑-3-基)-胺溶解於 10 ml 二氯甲烷中。使溶液冷卻至 0°C 且逐份添加 100 mg 70% 間氯-過苯甲酸。移除冷卻浴且在室溫下持續攪拌 30 min。將溶液傾入 Na₂CO₃ 溶液中。分離各層且以 Na₂CO₃ 溶液及水洗滌有機

層。使有機層經 NaSO_4 乾燥且濃縮。藉由逆相HPLC(溶離劑：乙腈/水)純化粗產物以產生40 mg(0.18 mmol)標題產物。

B. 抗害蟲作用之生物學實例

在50體積%丙酮:50體積%水之混合物中調配活性化合物。該溶液中包括體積為0.01% v/v之非離子界面活性劑(Kinetic[®])。

在下列測試中，將活性化合物之經調配溶液稀釋成活性成份濃度為300 ppm，且在下文所提及之測試中應用該等經稀釋溶液。

藉由下列實驗證明式I化合物抵抗害蟲之作用。

B.1 棉蚜(*aphis gossypii*)，混合生命階段

在處理前藉由將來自主要蚜蟲群落之受嚴重侵襲之葉片置放於各子葉頂部來侵襲處於子葉階段之棉株。使蚜蟲遷移隔夜且移除寄主葉片。接著將受侵襲子葉浸入測試溶液中且攪動3秒且使其在通風櫥中乾燥。在25℃及20-40%相對濕度下，在螢光照明下將測試植物維持於24小時光週期中。5天後，相對於未經處理檢查植物上之死亡率來測定經處理植物上之蚜蟲死亡率。

在此測試中，與未經處理對照物相比，化合物實例1-9、11、13、14、17、19-22、26-46、49及50提供在300 ppm下至少86%之棉蚜(*Aphis gossypii*，混合生命階段)死亡率。

B.2 桃蚜(*Myzus persicae*)，混合生命階段

在處理前藉由將來自主要蚜蟲群落之受嚴重侵襲之葉片置放於處理植物頂部來侵襲處於第一真葉階段之甜椒植物。使蚜蟲遷移隔夜以達成每株植物30-40隻蚜蟲之侵襲且移除寄主葉片。接著將測試植物之受侵襲葉片浸入測試溶液中且攪動3秒且使其在通風櫥中乾燥。在25℃及20-40%相對濕度下，在螢光照明下將測試植物維持於24-小時光週期中。5天後，相對於未經處理檢查植物上之死亡率來測定經處理植物上之蚜蟲死亡率。

在此測試中，與未經處理對照物相比，化合物實例1-5、9、14、19、20、24、26-46、49及50提供在300 ppm下至少86%之桃蚜死亡率。

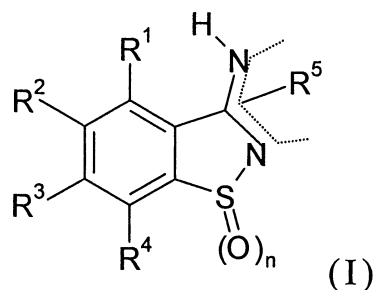
B.3 蠶豆蚜 (*Aphis fabae*)

藉由將受侵襲切片植物置放於測試植物頂部而以約2-30隻實驗室培養之蚜蟲來侵襲生長於Metro混合物中之處於第一葉對階段(品種"Mixed Jewel")的旱金蓮(nasturtium)植物。24小時後移除切片植物。將各植物浸入測試溶液中以提供葉、莖、突出種子表面及周圍立方表面之全面覆蓋且使其在通風櫥中乾燥。在連續螢光照明下，將經處理植物保持在約25℃下。3天後測定蚜蟲死亡率。

在此測試中，與未經處理對照物相比，化合物實例2-6、9、13、14、16、17及24提供在300 ppm下至少86%之蠶豆蚜死亡率。

五、中文發明摘要：

本發明係關於式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物：



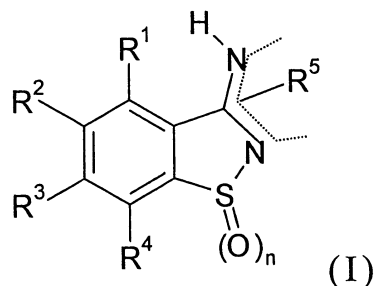
其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及 n 於說明書中定義。

本發明係關於式I之殺昆蟲化合物及其異構亞胺基衍生物，且係關於其對映異構體、非對映異構體及鹽且係關於包含此等化合物之組合物。本發明亦係關於3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物、其鹽或包含此等化合物之組合物用於對抗動物害蟲之用途。此外，本發明亦係關於應用此等化合物之方法。

六、英文發明摘要：

十、申請專利範圍：

1. 一種式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物：



其中

n 為 0、1 或 2；

R¹ 係選自 C₁-C₆烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆鹵烯基、C₂-C₆炔基、C₂-C₆鹵炔基、C₃-C₈環烷基、C₃-C₆鹵環烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆鹵烷氧基，其中該等所提及基團可未經取代或可攜帶 1、2 或 3 個選自由氰基、硝基、胺基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄烷基亞磺基、C₁-C₄烷基磺基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄鹵烷硫基、(C₁-C₄烷氧基)羰基、(C₁-C₄烷基)胺基、二(C₁-C₄烷基)胺基、胺基羰基、(C₁-C₄烷基)胺基羰基、二(C₁-C₄烷基)胺基羰基、C₃-C₈環烷基及苯基組成之群之基團，苯基可未經取代、部分或完全鹵化且/或可攜帶 1、2 或 3 個彼此獨立地選自由 CN、C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵烷基、C₁-C₄烷氧基及 C₁-C₄鹵烷氧基組成之群之取代基，且

R²、R³及 R⁴彼此獨立地選自由氫、鹵素、氰基、疊氮基、硝基、C₁-C₆烷基、C₃-C₈環烷基、C₁-C₄鹵烷

基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷基硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺基、 C_1 - C_4 烷基磺基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷基硫基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、(C_1 - C_4 烷氧基)羰基、胺基、(C_1 - C_4 烷基)胺基、二(C_1 - C_4 烷基)胺基、胺基羰基、(C_1 - C_4 烷基)胺基羰基、二(C_1 - C_4 烷基)胺基羰基、磺基、磺基胺基、次磺基胺基、硫基胺基及 $C(=O)-R^{2a}$ 或 $C(=O)-R^{3a}$ 或 $C(=O)-R^{4a}$ 組成之群，且其中

R^{2a} 或 R^{3a} 或 R^{4a} 係選自由氫、羥基、 C_1 - C_6 烷氧基、胺基、 C_1 - C_6 烷基、芳基、芳基- C_1 - C_6 烷基、(C_1 - C_6 烷基)-胺基、二(C_1 - C_6 烷基)-胺基、3至7員雜芳基或雜芳基- C_1 - C_4 烷基組成之群，其中該雜芳基環含有作為環成員的1、2或3個選自由氮、氧、硫組成之群的雜原子、基團 SO 、 SO_2 或 NR^{2b} 或 NR^{3b} 或 NR^{4b} ，且其中 R^{2b} 或 R^{3b} 或 R^{4b} 為氫、 C_1 - C_6 烷基或(C_1 - C_6 烷基)-羰基；

R^5 係選自由氫、 OR^{5a} 、 C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_2 - C_{10} 炔基、 C_3 - C_{10} 環烷基、芳基- C_1 - C_4 烷基、雜芳基- C_1 - C_4 烷基、雜環基- C_1 - C_4 烷基組成之群，其中此等基團可未經取代、部分或完全鹵化且/或可攜帶1-4個選自由 C_1 - C_{10} 烷氧基、 C_1 - C_{10} 烷基硫基、 C_1 - C_{10} 烷基亞磺基、 C_1 - C_{10} 烷基磺基、 C_1 - C_{10} 鹵烷氧基、 C_1 - C_{10} 鹵烷基硫基、(C_1 - C_{10} 烷氧基)羰基、氰基、硝基、胺基、(C_1 - C_{10} 烷基)胺基、二(C_1 - C_{10} 烷基)胺

基、 C_3-C_{10} 環烷基及苯基組成之群之基團，苯基可未經取代、部分或完全鹵化且/或可攜帶1-3個選自由CN、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基組成之群的取代基，且其中

R^{5a} 係選自氫、 C_1-C_{10} 烷基、 C_1-C_{10} -醯基、 C_3-C_{10} 環烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、芳基、芳基- C_1-C_4 烷基、雜芳基及雜芳基- C_1-C_4 烷基、雜環基或雜環基- C_1-C_4 烷基且其中所有基團可未經取代、部分或完全鹵化且/或可攜帶1、2或3個選自由氰基、硝基、胺基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亞磺醯基、 C_1-C_4 烷基磺醯基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷硫基、 $(C_1-C_4$ 烷氧基)羰基、 $(C_1-C_4$ 烷基)胺基、二 $(C_1-C_4$ 烷基)胺基及 C_3-C_8 環烷基組成之群之基團；

或其對映異構體、非對映異構體或鹽，

其限制條件為若n為0，則 R^5 不為氫。

2. 如請求項1之式I之3-胺基-1,2苯并異噻唑化合物，其中n為2。
3. 如請求項1之式I之3-胺基-1,2苯并異噻唑化合物，其中n為1。
4. 如請求項1之式I之3-胺基-1,2苯并異噻唑化合物，其中n為0。
5. 如請求項1之式I之3-胺基-1,2苯并異噻唑化合物，其中 R^1 係選自 C_1-C_6 烷氧基或 C_1-C_6 鹵烷氧基。

6. 如請求項1之式I之3-胺基-1,2苯并異噻唑化合物，其中
 R^1 係選自 C_1 - C_6 氟烷氧基或 C_1 - C_6 氯烷氧基。
7. 如請求項1之式I之3-胺基-1,2苯并異噻唑化合物，其中
 R^2 、 R^3 及 R^4 彼此獨立地選自由氫、F、Cl、Br或I組成之群。
8. 如請求項1之式I之3-胺基-1,2苯并異噻唑化合物，其中
 R^2 、 R^3 及 R^4 彼此獨立地為氫或氟基。
9. 如請求項1之式I之3-胺基-1,2苯并異噻唑化合物，其中
 R^2 、 R^3 及 R^4 為氫。
10. 如請求項1之式I之3-胺基-1,2苯并異噻唑化合物，其中
 R^5 係選自 C_1 - C_6 烷基，其可未經取代、部分或完全鹵化且/或可攜帶1-4個選自由 C_1 - C_{10} 烷氧基、 C_1 - C_{10} 烷硫基、 C_1 - C_{10} 烷基亞磺基、 C_1 - C_{10} 烷基磺基、 C_1 - C_{10} 鹵烷氧基、 C_1 - C_{10} 鹵烷硫基、(C_1 - C_{10} 烷氧基)羰基、氰基、硝基、胺基、(C_1 - C_{10} 烷基)胺基、二(C_1 - C_{10} 烷基)胺基、 C_3 - C_{10} 環烷基及苯基組成之群之基團，苯基可未經取代、部分或完全鹵化且/或可攜帶1-3個選自由CN、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基組成之群之取代基。
11. 如請求項1之式I之3-胺基-1,2苯并異噻唑化合物，其中 R^5 為氫且n為1或2。
12. 如請求項1之式I之3-胺基-1,2苯并異噻唑化合物，其中
 R^1 係選自 C_1 - C_6 烷氧基或 C_1 - C_6 鹵烷氧基且
 R^2 、 R^3 及 R^4 彼此獨立地選自由氫、F、Cl、Br或I組成

之群。

13. 如請求項1之式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物，其中

R^1 係選自 C_1 - C_6 烷氧基或 C_1 - C_6 鹵烷氧基且

R^2 、 R^3 及 R^4 為氫。

14. 如請求項1之式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物，其中

R^1 係選自 C_1 - C_6 烷氧基或 C_1 - C_6 鹵烷氧基；

R^2 、 R^3 及 R^4 彼此獨立地選自由氫、F、Cl、Br 或 I 組成之群；且

R^5 係選自 C_1 - C_6 烷基，其可未經取代、部分或完全鹵化且/或可攜帶1-4個選自由 C_1 - C_{10} 烷氧基、 C_1 - C_{10} 烷硫基、 C_1 - C_{10} 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_{10} 烷基磺醯基、 C_1 - C_{10} 鹵烷氧基、 C_1 - C_{10} 鹵烷硫基、(C_1 - C_{10} 烷氧基)羰基、氰基、硝基、胺基、(C_1 - C_{10} 烷基)胺基、二(C_1 - C_{10} 烷基)胺基、 C_3 - C_{10} 環烷基及苯基組成之群之基團，苯基可未經取代、部分或完全鹵化且/或可攜帶1-3個選自由CN、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基組成之群之取代基。

15. 一種組合物，其包含至少一種如請求項1至14中任一項之式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或其對映異構體、非對映異構體或鹽及至少一種惰性液體及/或固體載劑。

16. 一種農業組合物，其包含此一殺害蟲有效量之至少一種如請求項1至14中任一項之式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或其對映異構體、非對映異構體或農業上有用之鹽及至少一種惰性液體及/或固體農業上可接受之載劑及

視需要使用之至少一種界面活性劑。

17. 一種用於對抗或防治動物害蟲之方法，其包含使該等動物害蟲或其食物供應、棲所或繁殖區域與殺害蟲有效量之至少一種如請求項1至14中任一項之式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或其對映異構體、非對映異構體或鹽接觸或與包含至少一種此化合物之組合物接觸。
18. 一種用於保護生長植物免受動物害蟲攻擊或侵襲之方法，其包含使植物或該植物生長於其中之土壤或水與殺害蟲有效量之至少一種如請求項1至14中任一項之式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或其對映異構體、非對映異構體或鹽接觸或與包含至少一種此化合物之組合物接觸。
19. 如請求項17或18之方法，其中該等動物害蟲為昆蟲類、蜘蛛類節肢動物或線蟲類。
20. 如請求項17或18之方法，其中該動物害蟲係來自同翅目或繆翅目。
21. 一種用於保護種子免受土壤昆蟲侵害及保護幼苗之根及幼芽免受土壤昆蟲及葉昆蟲侵害之方法，該方法包含在播種之前及/或催芽之後使該等種子與至少一種如請求項1至14中任一項之式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或其對映異構體、非對映異構體或鹽或包含至少一種此式I化合物之組合物接觸。
22. 如請求項21之方法，其中該式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物係以每100公斤種子100 mg至10 kg之量施用。

23. 如請求項21之方法，其中所得植物之根及幼芽得以保護。

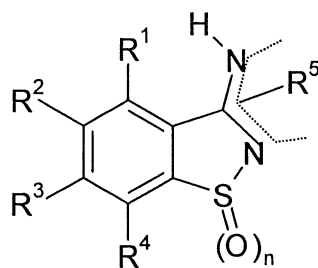
24. 如請求項21之方法，其中所得植物之幼芽得以保護而免受蚜蟲侵害。

25. 一種種子，其包含如請求項1至14中任一項之式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或其對映異構體、非對映異構體或農業上可接受之鹽，其量為每100公斤種子0.1 g至10 kg。

七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：(無)

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

(I)