



(21)申請案號：109134889

(22)申請日：中華民國 109 (2020) 年 10 月 08 日

(51)Int. Cl.：

C07D403/04 (2006.01)

A61K31/506 (2006.01)

A01N43/54 (2006.01)

A01N43/653 (2006.01)

A01P7/00 (2006.01)

A61P33/14 (2006.01)

(30)優先權：2019/10/09

歐洲專利局

19202288.7

(71)申請人：德商拜耳廠股份有限公司 (德國) BAYER AKTIENGESELLSCHAFT (DE)
德國

(72)發明人：耶施克 彼得 JESCHKE, PETER (DE)；施瓦茨 漢斯 喬治 SCHWARZ, HANS-GEORG (DE)；阿爾特 亞歷山大 ARLT, ALEXANDER (DE)；菲斯林 馬丁 FUESSLEIN, MARTIN (DE)；坎喬格蘭德 尤蘭達 CANCHO GRANDE, YOLANDA (ES)；特勒斯爾 約希姆 TELSER, JOACHIM (DE)；帕澤諾克 塞爾吉 PAZENOK, SERGII (DE)；羅素 彼得 LOESEL, PETER (GB)；林卡 馬克 LINKA, MARC (DE)；艾賓豪斯 金策爾 烏爾里希 EBBINGHAUS-KINTSCHER, ULRICH (DE)；達米喬尼蒂斯 阿魯納斯 DAMIJONAITIS, ARUNAS JONAS (DE)；海斯勒 艾倫 HEISLER, IRING (DE)；特伯格 安德烈亞斯 TURBERG, ANDREAS (DE)

(74)代理人：何愛文；王仁君

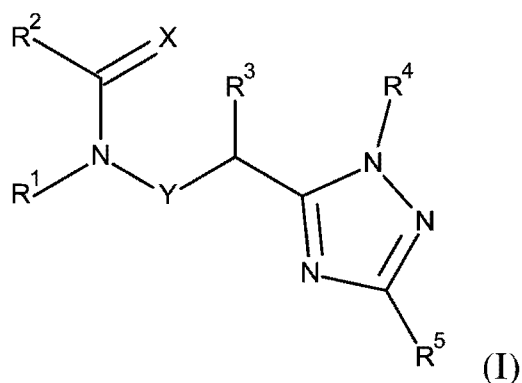
申請實體審查：無 申請專利範圍項數：17 項 圖式數：0 共 169 頁

(54)名稱

作為殺蟲劑之新穎雜芳基三唑化合物

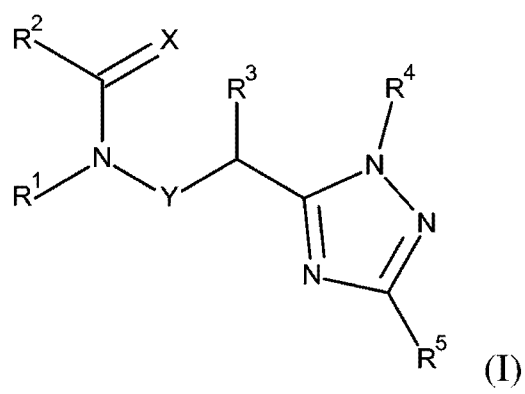
(57)摘要

本發明係有關一種新穎之通式(I)雜芳基三唑化合物，其中結構元素 X、Y、R¹、R²、R³、R⁴ 及 R⁵ 具有本說明書中指示之定義，並有關包含此等化合物之調配物及組成物，及其等於植物保護中防治動物害蟲(包括節肢動物及昆蟲)上之用途，及其等於防治動物之體外寄生蟲上之用途。

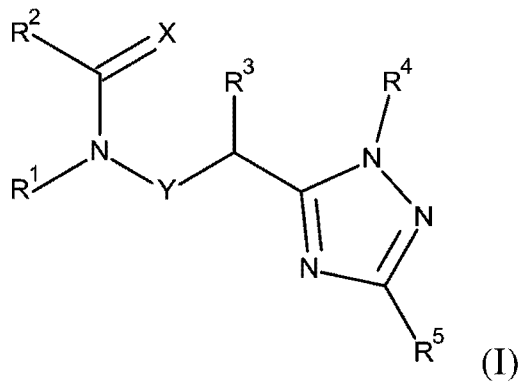


The present invention relates to novel heteroaryl-triazole compounds of the general formula (I), in which the structural elements X, Y, R¹, R², R³, R⁴ and R⁵ have the meaning given in the description, to formulations

and compositions comprising such compounds and for their use in the control of animal pests including arthropods and insects in plant protection and to their use for control of ectoparasites on animals.



特徵化學式：





202128663

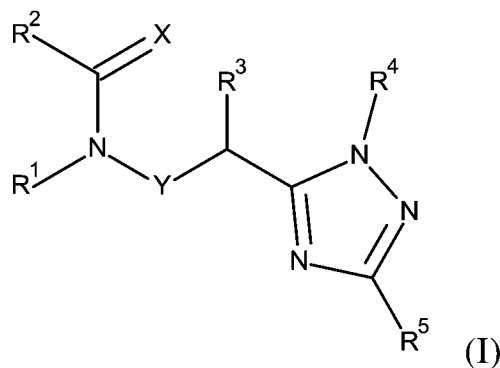
【發明摘要】

【中文發明名稱】 作為殺蟲劑之新穎雜芳基三唑化合物

【英文發明名稱】 NOVEL HETEROARYL-TRIAZOLE COMPOUNDS AS PESTICIDES

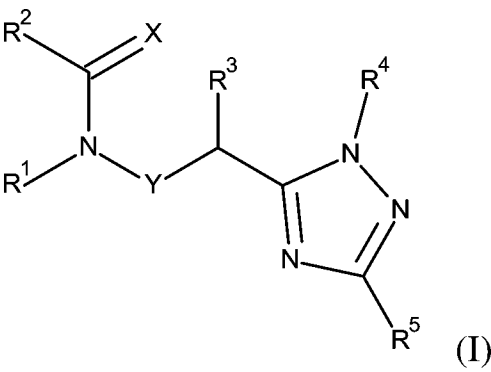
【中文】

本發明係有關一種新穎之通式(I)雜芳基三唑化合物，其中結構元素 X、Y、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及 R^5 具有本說明書中指示之定義，並有關包含此等化合物之調配物及組成物，及其等於植物保護中防治動物害蟲(包括節肢動物及昆蟲)上之用途，及其等於防治動物之體外寄生蟲上之用途。



【英文】

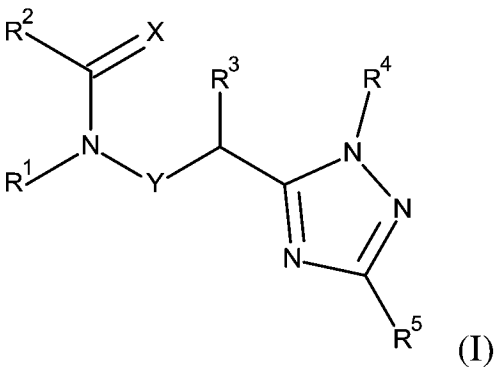
The present invention relates to novel heteroaryl-triazole compounds of the general formula (I), in which the structural elements X, Y, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 and R^5 have the meaning given in the description, to formulations and compositions comprising such compounds and for their use in the control of animal pests including arthropods and insects in plant protection and to their use for control of ectoparasites on animals.



【指定代表圖】 無

【代表圖之符號簡單說明】 無

【特徵化學式】



【發明說明書】

【中文發明名稱】 作為殺蟲劑之新穎雜芳基三唑化合物

【英文發明名稱】 NOVEL HETEROARYL-TRIAZOLE COMPOUNDS AS
PESTICIDES

【技術領域】

【0001】 本發明係有關一種新穎雜芳基三唑化合物、包含此等化合物之調配物及組成物、及其等於植物保護上防治動物害蟲(包括節肢動物及昆蟲)之用途、及其等於防治動物之體外寄生蟲上之用途。

【先前技術】

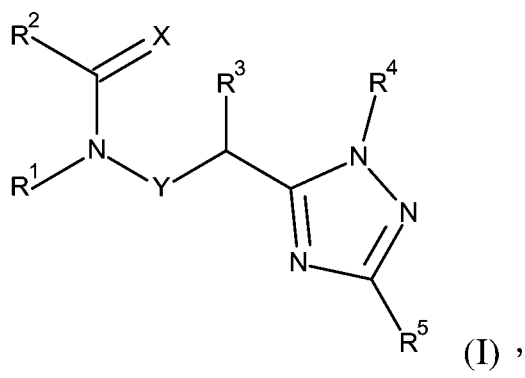
【0002】 某些式I雜芳基三唑化合物已在WO 2017/192385中揭示用於防治動物之體外寄生蟲，及在WO 2019/170626及WO 2019/215198中揭示用於植物保護領域中防治動物害蟲，包括節肢動物及昆蟲。此外，專利申請案WO 2019/197468、WO 2019/201835、WO 2019/202077及WO 2019/206799揭示某些雜芳基三唑化合物用於防治動物之體外寄生蟲及在植物保護領域中防治動物害蟲，包括節肢動物及昆蟲。WO 2020/002563、WO 2020/053364、WO 2020/053365、WO 2020/079198、WO 2020/094363、EP3696175 A1說明其唑-醯胺(azole-amide)化合物均可用為殺昆蟲劑。

【0003】 現代植物保護產品及獸用殺體外寄生蟲劑必須符合許多要求，例如：與其效力、持續性、作用範圍、及突破抗性性質等相關方面。有關毒性、與其他活性化合物或調配輔劑之相容性問題、及活性化合物之合成所需成本問題，均扮演某種角色。此外，還可能發生抗性。僅基於所有此等理由，即認為尚未完成新穎作物保護組成物或獸用殺體外寄生蟲劑之搜尋，仍然需要至少在個別相關態樣上比已知化合物具有更佳性質之新穎化合物。

【發明內容】

【0004】 本發明之目的在於提供一種可以在各種不同態樣中擴大殺蟲劑作用範圍之化合物。

【0005】 本發明因此提供一種通式(I)化合物



其中(組態1-1)：

- X 為O或S；
- Y 為直接鍵結或CH₂；
- R¹ 為氫；C₁-C₆烷基，其可視需要經選自下列之一個取代基取代：-CN、-CONH₂、-COOH、-NO₂及-Si(CH₃)₃；C₁-C₆鹵烷基；C₂-C₆烯基；C₂-C₆鹵烯基；C₂-C₆炔基；C₂-C₆鹵炔基；C₃-C₄環烷基-C₁-C₂烷基-，其中C₃-C₄環烷基可視需要經一個或兩個鹵原子取代；氧雜環丁烷-3-基-CH₂-或苯甲基，其可視需要經鹵原子或C₁-C₃鹵烷基取代；
- R² 為苯基、吡啶、嘧啶、吡嗪或噻嗪，其中苯基、吡啶、嘧啶、吡嗪或噻嗪可視需要經一至三個取代基取代，其限制條件為該(等)取代基並不位在C=X-基團所鍵結碳之任一相鄰碳上，其分別獨立選自下列各項所組成群組中：C₁-C₃烷基、C₁-C₃鹵烷基、C₁-C₃鹵烷基硫、C₁-C₃烷氧基、C₁-C₃鹵烷氧基、鹵素、-NO₂、-SF₅、-CN、-CONH₂、-COOH及-C(S)NH₂；
- R³ 為C₁-C₃烷基或C₁-C₃鹵烷基；
- R⁴ 為吡啶、嘧啶、吡嗪或噻嗪，其中吡啶、嘧啶、吡嗪或噻嗪可視需要經選自下列各項所組成群組中之一個取代基取代：C₁-C₃烷基、C₁-C₃鹵烷基、C₁-C₃烷氧基、C₃-C₄環烷基、鹵素或羥基；

R^5 為鹵素。

【0006】 式(I)化合物同樣涵蓋任何存在之非對映異構物或對映異構物及E/Z異構物，及式(I)化合物之鹽類與N-氧化物，及其等於防治動物害蟲上之用途。

【0007】 上文及下文明確指示之化學式其較佳之基團定義如下。

【0008】 進一步較佳(組態2-1)為式(I)化合物，其中

X 為O或S；

Y 為直接鍵結或 CH_2 ；

R^1 為氫； C_1 - C_3 烷基，其可視需要經選自下列之一個取代基取代： $-CN$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-NO_2$ 及 $-Si(CH_3)_3$ ； C_1 - C_3 鹵烷基； C_2 - C_4 烯基； C_2 - C_4 鹵烯基； C_2 - C_4 炔基； C_2 - C_4 鹵炔基； C_3 - C_4 環烷基- C_1 - C_2 烷基-，其中 C_3 - C_4 環烷基可視需要經一個或兩個鹵原子取代；氧雜環丁烷-3-基- CH_2 -；或苯甲基，其可視需要經鹵原子或 C_1 - C_3 鹵烷基取代；

R^2 為苯基、吡啶、嘧啶、吡嗪或嗒嗪，其中苯基、吡啶、嘧啶、吡嗪或嗒嗪可視需要經一至三個取代基取代，其限制條件為該(等)取代基並不位在 $C=X$ -基團所鍵結碳之任一相鄰碳上，其分別獨立選自下列各項所組成群組中： C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基硫、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 鹵烷氧基、鹵素、 $-NO_2$ 、 $-SF_5$ 、 $-CN$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COOH$ 及 $-C(S)NH_2$ ；

R^3 為 C_1 - C_3 烷基或 C_1 - C_3 鹵烷基；

R^4 為吡啶、嘧啶、吡嗪或嗒嗪，其中吡啶、嘧啶、吡嗪或嗒嗪可視需要經選自下列各項所組成群組中之一個取代基取代： C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_3 - C_4 環烷基、鹵素或羥基；

R^5 為鹵素。

【0009】 特別佳(組態3-1)為式(I)化合物，其中

X 為O；

Y 為直接鍵結；

R^1 為氫；

R^2 為苯基或吡啶，其中苯基或吡啶可視需要經一至三個取代基取代，其限制條件為該(等)取代基並不位在C=X-基團所鍵結碳之任一相鄰碳上，其分別獨立選自下列各項所組成群組中：氟、氯、溴、-CN、-NO₂、-SF₅、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、二氟甲氧基、二氟甲基硫、及三氟甲基硫；

R^3 為C₁-C₃烷基；

R^4 為吡啶或嘧啶，其中吡啶或嘧啶可視需要經選自下列各項所組成群組中之一個取代基取代：氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基；

R^5 為氟、氯、溴、或碘。

【0010】 極特別佳(組態4-1)為式(I)化合物，其中

X 為O；

Y 為直接鍵結；

R^1 為氫；

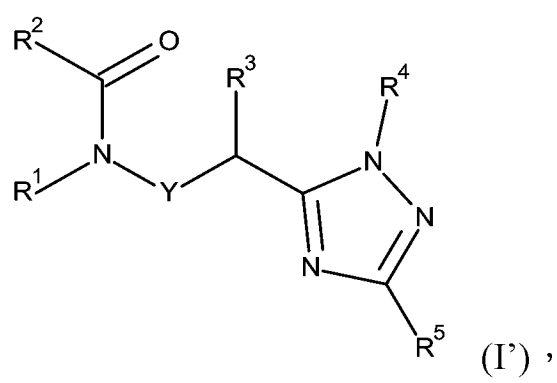
R^2 3-氯-5-(三氟甲基)苯基、3-溴-5-(三氟甲基)苯基、3-氯-5-(三氟甲氧基)苯基、3-溴-5-(三氟甲氧基)苯基、3-溴-5-氯苯基、3,5-二氯苯基、3,5-二溴苯基、3,5-雙(三氟甲基)苯基、2,6-二氯-吡啶-4-基、5-(三氟甲基)-吡啶-3-基、或2-氯-6-(三氟甲基)-吡啶-4-基；

R^3 為甲基；

R^4 為嘧啶-2-基、或5-氯-吡啶-2-基；

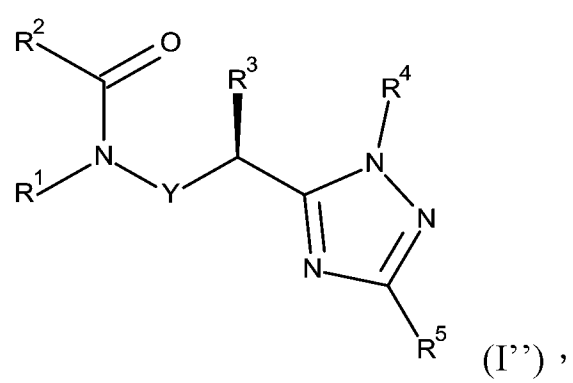
R^5 為氯、溴或碘。

【0011】 進一步較佳實施例中，本發明係有關一種式(I')化合物



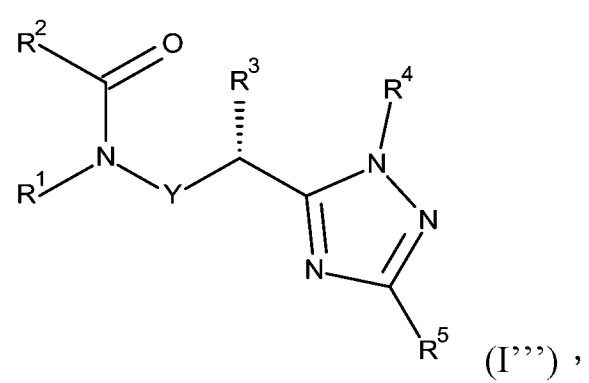
其中結構元素Y、R¹、R²、R³、R⁴及R⁵具有組態(1-1)中指示之定義或組態(2-1)中指示之定義或組態(3-1)中指示之定義或組態(4-1)中指示之定義。

【0012】 進一步較佳實施例中，本發明係有關一種式(I'')化合物，其中R³ 為C₁-C₃烷基，尤其佳為甲基，及



其中Y 為直接鍵結，及結構元素R¹、R²、R⁴及R⁵具有組態(1-1)中指示之定義或組態(2-1)中指示之定義或組態(3-1)中指示之定義或組態(4-1)中指示之定義。

【0013】 進一步較佳實施例中，本發明係有關一種式(I''')化合物，其中R³ 為C₁-C₃烷基，尤其佳為甲基，及

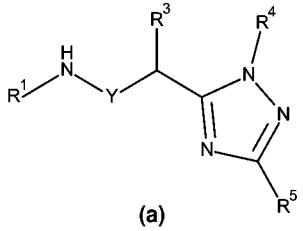


其中Y 為直接鍵結，及結構元素R¹、R²、R⁴及R⁵具有組態(1-1)中指示之定義或組態(2-1)中指示之定義或組態(3-1)中指示之定義或組態(4-1)中指示之定義。

【0014】 根據另一項態樣，本發明涵蓋適用於製備如上述通式(I)化合物之中間化合物。

【0015】 根據另一項態樣，本發明涵蓋適用於製備如上述通式(I)化合物之中間化合物。

【0016】 特定言之，本發明涵蓋通式(a)化合物之中間化合物，其中 R^1 為氫， R^3 為甲基，及Y為直接鍵結，及其中 R^4 及 R^5 具有組態(3-1)中指示之定義或組態(4-1)中指示之定義。



【0017】 特定言之，本發明涵蓋中間化合物(INT-01至INT-06) (參見表2)：

INT-01：1-(5-氯-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺； R^4 = 嘧啶-2-基及 R^5 = Cl，

INT-02：1-(5-溴-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺； R^4 = 嘧啶-2-基及 R^5 = Br，

INT-03：1-(5-碘-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺； R^4 = 嘧啶-2-基及 R^5 = I，

INT-04：(1S)-1-(5-氯-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺-鹽酸鹽； R^4 = 嘧啶-2-基及 R^5 = Cl，

INT-05：(1S)-1-(5-溴-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺-鹽酸鹽； R^4 = 嘧啶-2-基及 R^5 = Br，

INT-06：(1S)-1-(5-碘-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺-鹽酸鹽； R^4 = 嘧啶-2-基及 R^5 = I。

【0018】 式(I)化合物亦可能隨取代基性質而定，而呈立體異構物型式，亦即幾何與/或光學活性異構物或不同組成之異構物混合物型式。本發明提供純的立體異構物及此等異構物之任何所需混合物，即使本文通常僅討論式(I)化合物。

【0019】 然而，較佳係指根據本發明使用式(I)化合物及其鹽類之光學活性立體異構物型式。

【0020】 本發明因此係有關純的對映異構物及非對映異構物二者，及其混合物，用於防治動物害蟲，包括節肢動物及特別指昆蟲。

【0021】 若適當時，式(I)化合物可能呈各種不同多晶型或呈各種不同多晶型之混合物。純多晶型及多晶型混合物均為本發明所提供，並可根據本發明使用。

【圖式簡單說明】

無

【實施方式】

定義

【0022】 習此相關技藝之人士咸了解，若沒有明確說明時，用於本申請案之術語「一個」或「一種」可能依狀況而定，意指「一(1)個(種)」、「一(1)或更多個(種)」或「至少一(1)個(種)」。

【0023】 本文說明之所有結構式中，如：環系及基團，相鄰之原子不可以為-O-O-或-O-S-。

【0024】 具有可變化可能碳原子(C原子)數之結構式在本申請案中稱為 $C_{\text{碳原子下}}^{\text{碳原子上}}$ 結構式($C_{LL}-C_{UL}$ 結構式)，以便更明確規定。實例：烷基可能由3至10碳原子組成，此時對應於 C_3-C_{10} 烷基。由碳原子及雜原子構成之環結構可能稱為「LL-至UL-員」結構。一種6-員環結構之實例為甲苯(經甲基取代之6-員環結構)。

【0025】 若有取代基之統稱名詞(例如： $C_{LL}-C_{UL}$ 烷基)出現在複合取代基(例如： $C_{LL}-C_{UL}$ 環烷基- $C_{LL}-C_{UL}$ 烷基)之末端，則出現在該複合取代基開端之組成份(例如： $C_{LL}-C_{UL}$ 環烷基)可能分別獨立經相同或不同之後述取代基(例如： $C_{LL}-C_{UL}$ 烷基)單取代或多取代。本申請案在化學基團、環系及環狀基團採用之所有統稱名詞均透過增加「 $C_{LL}-C_{UL}$ 」或「LL-至UL-員」而更明確規定。

【0026】 上述化學式所指定代號之定義中，採用一般代表下列取代基之統稱名詞：

【0027】 鹵素係有關第七主族元素，較佳為氟、氯、溴及碘，更佳為氟、氯及溴，及甚至更佳為氟及氯。

【0028】 雜原子實例為N、O、S、P、B、Si。較佳地，術語「雜原子」係有關N、S及O。

【0029】 根據本發明，「烷基」－本身或作為化學基團之一部份－代表直鏈或分支之烴，其較佳具有1至6個碳原子，例如：甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、第二丁基、第三丁基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、1,2-二甲基丙基、1,1-二甲基丙基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、己基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,2-二甲基丙基、1,3-二甲基丁基、1,4-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、1,1-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基丁基及2-乙基丁基。較佳亦指具有1至4個碳原子之烷基，如，特別指：甲基、乙基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、第二丁基或第三丁基。本發明烷基可經一或多個相同或不同基團取代。

【0030】 根據本發明，「烯基」－本身或作為化學基團之一部份－代表較佳具有2至6個碳原子及至少一個雙鍵之直鏈或分支之烴，例如：乙烯基、2-丙烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、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-2-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、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、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-2-丁烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-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

基及1-乙基-2-甲基-2-丙烯基。較佳亦指具有2至4個碳原子之烯基，如，特別指：2-丙烯基、2-丁烯基或1-甲基-2-丙烯基。本發明烯基可經一或多個相同或不同基團取代。

【0031】 根據本發明，「炔基」－本身或作為化學基團之一部份－代表較佳具有2至6個碳原子及至少一個參鍵之直鏈或分支之烴，例如：2-丙炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、1-甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基、1-乙基-2-丙炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、1-甲基-2-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-3-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、3-甲基-4-戊炔基、4-甲基-2-戊炔基、1,1-二甲基-3-丁炔基、1,2-二甲基-3-丁炔基、2,2-二甲基-3-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-乙基-3-丁炔基、1-乙基-1-甲基-2-丙炔基及2,5-己二炔基。較佳亦指具有2至4個碳原子之炔基，如，特別指：乙炔基、2-丙炔基或2-丁炔基-2-丙烯基。本發明炔基可經一或多個相同或不同基團取代。

【0032】 根據本發明，「環烷基」－本身或作為化學基團之一部份－代表單環-、雙環-或三環烴，較佳係具有3至10個碳，例如：環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基、環辛基、雙環[2.2.1]庚基、雙環[2.2.2]辛基或金剛烷基。較佳亦指具有3、4、5、6或7個碳原子之環烷基，如，特別指：環丙基或環丁基。本發明之環烷基可經一或多個相同或不同基團取代。

【0033】 根據本發明，「烷基環烷基」代表較佳具有4至10個或4至7個碳原子之單環-、雙環-或三環狀烷基環烷基，例如：甲基環丙基、乙基環丙基、異丙基環丁基、3-甲基環戊基及4-甲基環己基。較佳亦指具有4、5或7個碳原子之烷基環烷基，如，特別指：乙基環丙基或4-甲基環己基。本發明之烷基環烷基可經一或多個相同或不同基團取代。

【0034】 根據本發明，「環烷基烷基」代表較佳具有4至10個或4至7個碳原子單環-、雙環-或三環狀環烷基烷基，例如：環丙基甲基、環丁基甲基、環戊基甲基、環己基甲基及環戊基乙基。較佳亦指具有4、5或7個碳原子之環烷基烷基，

如，特別指：環丙基甲基或環丁基甲基。本發明之環烷基烷基可經一或多個相同或不同基團取代。

【0035】 根據本發明，「羥基烷基」代表較佳具有1至6個碳原子之直鏈或分支之醇，例如：甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、第二丁醇及第三丁醇。較佳亦指具有1至4個碳原子之羥基烷基。本發明之羥基烷基可經一或多個相同或不同基團取代。

【0036】 根據本發明，「烷氧基」代表較佳具有1至6個碳原子之直鏈或分支之O-烷基，例如：甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、異丁氧基、第二丁氧基及第三丁氧基。較佳亦指具有1至4個碳原子之烷氧基。本發明之烷氧基可經一或多個相同或不同基團取代。

【0037】 根據本發明，「烷基硫」、或「烷基氫硫基」代表較佳具有1至6個碳原子之直鏈或分支之S-烷基，例如：甲基硫、乙基硫、正丙基硫、異丙基硫、正丁基硫、異丁基硫、第二丁基硫及第三丁基硫。較佳亦指具有1至4個碳原子之烷基硫基團。本發明之烷基硫基團可經一或多個相同或不同基團取代。

【0038】 根據本發明，「烷基亞磺醯基」代表較佳具有1至6個碳原子之直鏈或分支之烷基亞磺醯基，例如：甲基亞磺醯基、乙基亞磺醯基、正丙基亞磺醯基、異丙基亞磺醯基、正丁基亞磺醯基、異丁基亞磺醯基、第二丁基亞磺醯基及第三丁基亞磺醯基。較佳亦指具有1至4個碳原子之烷基亞磺醯基。本發明之烷基亞磺醯基可經一個或多個相同或不同基團取代，且包括兩種對映異構物。

【0039】 根據本發明，「烷基磺醯基」代表較佳具有1至6個碳原子之直鏈或分支之烷基磺醯基，例如：甲基磺醯基、乙基磺醯基、正丙基磺醯基、異丙基磺醯基、正丁基磺醯基、異丁基磺醯基、第二丁基磺醯基及第三丁基磺醯基。較佳亦指具有1至個4個碳原子之烷基磺醯基。本發明之烷基磺醯基可經一或多個相同或不同基團取代。

【0040】 根據本發明，「環烷基硫」或「環烷基氫硫基」代表較佳具有3至6個碳原子之-S-環烷基，例如：環丙基硫、環丁基硫、環戊基硫、環己基硫。較

佳亦指具有3至5個碳原子之環烷基硫基團。本發明之環烷基硫基團可經一或多個相同或不同基團取代。

【0041】 根據本發明，「環烷基亞磺醯基」代表較佳具有3至6個碳原子之-S(O)-環烷基，例如：環丙基亞磺醯基、環丁基亞磺醯基、環戊基亞磺醯基、環己基亞磺醯基。較佳亦指具有3至5個碳原子之環烷基亞磺醯基。本發明之環烷基亞磺醯基可經一個或多個相同或不同基團取代，並且包括兩種對映異構物。

【0042】 根據本發明，「環烷基磺醯基」代表較佳具有3至6個碳原子之-SO₂-環烷基，例如：環丙基磺醯基、環丁基磺醯基、環戊基磺醯基、環己基磺醯基。較佳亦指具有3至5個碳原子之環烷基磺醯基。本發明之環烷基磺醯基可經一或多個相同或不同基團取代。

【0043】 根據本發明，「苯基硫」或「苯基氫硫基」代表-S-苯基，例如：苯基硫。本發明苯基硫基團可經一或多個相同或不同基團取代。

【0044】 根據本發明，「苯基亞磺醯基」代表-S(O)-苯基，例如：苯基亞磺醯基。本發明之苯基亞磺醯基可經一個或多個相同或不同基團取代，並且包括兩種對映異構物。

【0045】 根據本發明，「苯基磺醯基」代表-SO₂-苯基，例如：苯基磺醯基。本發明之苯基磺醯基可經一或多個相同或不同基團取代。

【0046】 根據本發明，「烷基羰基」代表較佳具有2至7個碳原子之直鏈或分支之烷基-C(=O)，如：甲基羰基、乙基羰基、正丙基羰基、異丙基羰基、第二丁基羰基及第三丁基羰基。較佳亦指具有1至4個碳原子之烷基羰基。本發明之烷基羰基可經一或多個相同或不同基團取代。

【0047】 根據本發明，「烷氧基羰基」-單獨或作為化學基團之組成份-代表較佳在烷氧基部份基團中具有1至6個碳原子或具有1至4個碳原子之直鏈或分支之烷氧基羰基，例如：甲氧基羰基、乙氧基羰基、正丙氧基羰基、異丙氧基羰基、第二丁氧基羰基及第三丁氧基羰基。本發明之烷氧基羰基可經一或多個相同或不同基團取代。

【0048】 根據本發明，「烷基胺基羰基」代表較佳在烷基部份基團中具有1至6個碳原子或1至4個碳原子之直鏈或分支之烷基胺基羰基，例如：甲基胺基羰基、乙基胺基羰基、正丙基胺基羰基、異丙基胺基羰基、第二丁基胺基羰基及第三丁基胺基羰基。本發明之烷基胺基羰基可經一或多個相同或不同基團取代。

【0049】 根據本發明，「*N,N*-二烷基胺基羰基」代表較佳在烷基部份基團中具有1至6個碳原子或1至4個碳原子之直鏈或分支之*N,N*-二烷基胺基羰基，例如：*N,N*-二甲基胺基羰基、*N,N*-二乙基胺基羰基、*N,N*-二(正丙基胺基)羰基、*N,N*-二(異丙基胺基)羰基及*N,N*-二-(第二丁基胺基)羰基。本發明之*N,N*-二烷基胺基羰基可經一或多個相同或不同基團取代。

【0050】 根據本發明，「芳基」代表較佳具有6至14個，特別係6至10個環碳原子之單環-、雙環-或多環芳香系，例如：苯基、萘基、蒽基、菲基，較佳為苯基。此外，芳基亦代表多環系，如：四氫萘基、茚基、茚滿基、芴基、聯苯基，其中鍵結位點在芳香系上。本發明之芳基可經一或多個相同或不同基團取代。

【0051】 經取代之芳基實例為芳基烷基，其同樣可在C₁-C₄烷基及/或C₆-C₁₄芳基部份基團上經一或多個相同或不同基團取代。此等芳基烷基實例包括苯甲基及苯基-1-乙基。

【0052】 根據本發明，「雜環」、「雜環系環」或「雜環系」代表碳環系中至少一個環的其中至少一個碳原子被雜原子置換，較佳為被選自N、O、S、P、B、Si、Se所組成群中之雜原子置換，且其係飽和、不飽和或雜芳香系，且可能未經取代或經取代，其中鍵結位點在環系上。除非另有不同的說明，否則雜環系環較佳係在雜環系環中包含3至9個環原子，特別係3至6個環原子，及一或多個，較佳為1至4個，特別係1、2或3個雜原子，較佳為選自N、O、及S所組成群中，但不應有2個氧原子直接相鄰。雜環系環通常包含不超過4個氮原子及/或不超過2個氧原子及/或不超過2個硫原子。當雜環基或雜環系環可視需要經取代時，其可能與其他碳環或雜環系環稠合。以可視需要經取代之雜環基為例，本發明亦涵蓋多環系，例如：8-氮雜雙環[3.2.1]辛基或1-氮雜雙環[2.2.1]庚基。以

可視需要經取代之雜環基為例，本發明亦涵蓋螺環系，例如：1-氧雜-5-氮雜螺[2.3]己基。

【0053】 本發明雜環基為例如：哌啶基、哌嗪基、嗎啉基、硫嗎啉基、二氫哌喃基、四氫哌喃基、二氧雜環己烷基、吡咯啉基、吡咯啶基、咪唑啉基、咪唑啶基、噻唑啶基、噁唑啶基、二氧雜環戊烷基、二氧雜環戊烯基、吡唑啶基、四氫呋喃基、二氫呋喃基、氧雜環丁烷基、環氧乙烷基、氮雜環丁烷基、氮雜環丙烷基、氧氮雜環丁烷基、氧氮雜環丙烷基、氧氮雜環庚烷基、氧氮雜環己烷基、氮雜環庚烷基、氧代吡咯啶基、二氧代吡咯啶基、氧代嗎啉基、氧代哌嗪基及氧雜環庚烷基。

【0054】 特別重要者為雜芳基，亦即雜芳香系。根據本發明，術語雜芳基代表雜芳香系化合物，亦即完全不飽和芳香系雜環化合物，其係依上述雜環之定義。較佳係指具有1至3個，較佳為1或2個選自上述群組中之相同或不同雜原子之5-至7-員環。本發明雜芳基為例如：呋喃基、噻吩基、吡唑基、咪唑基、1,2,3-及1,2,4-三唑基、異噁唑基、噻唑基、異噻唑基、1,2,3-、1,3,4-、1,2,4-及1,2,5-噁二唑基、氮雜環庚烯基、吡咯基、吡啶基、嗒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、1,3,5-、1,2,4-及1,2,3-三嗪基、1,2,4-、1,3,2-、1,3,6-及1,2,6-噁嗪基、氧雜環庚烯基、硫雜環庚烯基、1,2,4-三唑酮基及1,2,4-二氮雜環庚烯基。本發明雜芳基亦可經一或多個相同或不同基團取代。

【0055】 術語「(可視需要)經取代之」基團/取代基，如：經取代之烷基、烯基、炔基、烷氧基、烷基硫、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、環烷基、芳基、苯基、苯甲基、雜環基及雜芳基，意指例如：衍生自未經取代之基本結構之經取代基團，其中取代基為例如：一(1)個取代基或複數個取代基，較佳為1、2、3、4、5、6或7個選自下列各項所組成群組中之取代基：胺基、羥基、鹵素、硝基、氰基、異氰基、氫硫基、異硫代氰醯基、C₁-C₄羧基、甲醯胺、SF₅、胺基磺醯基、C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵烷基 C₃-C₄環烷基、C₂-C₄烯基、C₅-C₆環烯基、C₂-C₄炔基、N-單-C₁-C₄烷基胺基、N,N-二-C₁-C₄烷基胺基、N-C₁-C₄烷醯基胺基、C₁-C₄烷氧基、

C₁-C₄鹵烷基氧基、C₂-C₄烯基氧、C₂-C₄炔基氧、C₃-C₄環烷基氧基、C₅-C₆環烯基氧、C₁-C₄烷基氧基羰基、C₂-C₄烯基氧基羰基、C₂-C₄炔基氧基羰基、C₆-、C₁₀-、C₁₄-芳基氧基羰基、C₁-C₄烷基酯基、C₂-C₄烯基酯基、C₂-C₄炔基酯基、C₆-、C₁₀-、C₁₄-芳基酯基、C₁-C₄烷基硫、C₁-C₄鹵烷基硫、C₃-C₄環烷基硫、C₂-C₄烯基硫、C₅-C₆環烯基硫、C₂-C₄炔基硫、C₁-C₄烷基亞磺基(包括C₁-C₄烷基亞磺基之兩種對映異構物)、C₁-C₄鹵烷基亞磺基(包括C₁-C₄鹵烷基亞磺基之兩種對映異構物)、C₁-C₄烷基磺基、C₁-C₄鹵烷基磺基、*N*-單-C₁-C₄烷基胺基磺基、*N,N*-二-C₁-C₄烷基胺基磺基、C₁-C₄烷基膦基、C₁-C₄烷基膦基(包括C₁-C₄烷基膦基及C₁-C₄烷基膦基之兩種對映異構物)、*N*-C₁-C₄烷基胺基羰基、*N,N*-二-C₁-C₄烷基胺基羰基、*N*-C₁-C₄烷基酯基胺基羰基、*N*-C₁-C₄烷基酯基-*N*-C₁-C₄烷基胺基羰基、C₆-、C₁₀-、C₁₄-芳基、C₆-、C₁₀-、C₁₄-芳基氧、苯甲基、苯甲基氧、苯甲基硫、C₆-、C₁₀-、C₁₄-芳基硫、C₆-、C₁₀-、C₁₄-芳基胺基、苯甲基胺基、雜環基及三烷基矽烷基，利用雙鍵鍵結之取代基，如：C₁-C₄亞烷基(例如：亞甲基或亞乙基)、側氧基、亞胺基及經取代之亞胺基。當兩個或更多個基團形成一或多個環時，此等可為碳環、雜環、飽和、部份飽和、不飽和，例如：包括芳香環及進一步取代。若其等包含碳氫組份時，可述及之取代基實例(「第一層取代」)可視需要在其中進一步經取代(「第二層取代」)，例如：經一或多個分別獨立選自下列各項所組成群組中之取代基取代：鹵素、羥基、胺基、硝基、氰基、異氰基、疊氮基、酯基胺基、側氧基及亞胺基，術語「(可視需要)經取代之」基團較佳涵蓋僅一層或兩層取代基。

【0056】 本發明經鹵素取代之化學基團或鹵化基團(例如：烷基或烷氧基)為經鹵素單取代或多取代，至高達最多可能取代基數量。此等基團亦稱為鹵代基(例如：鹵烷基)。以經鹵素多取代為例，鹵原子可能相同或不同，且可能均鍵結在一個碳原子，或可能鍵結複數個碳原子。鹵素特別係氟、氯、溴或碘，較佳為氟、氯或溴，及更佳為氟。更特定言之，經鹵素取代之基團為單鹵環烷基，如：1-氟環丙基、2-氟環丙基或1-氟環丁基；單鹵烷基，如：2-氯乙基、2-氟乙基、

1-氯乙基、1-氟乙基、氯甲基、或氟甲基；全鹵烷基，如：三氯甲基或三氟甲基或 CF_2CF_3 ；多鹵烷基，如：二氟甲基、2-氟-2-氯乙基、二氯甲基、1,1,2,2-四氟乙基或2,2,2-三氟乙基。其他鹵烷基實例為三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、氯甲基、溴甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、五氟乙基、3,3,3-三氟丙基及五氟-第三丁基。較佳係指具有1至4個碳原子及1至9個，較佳為1至5個選自氟、氯與溴所組成群中之相同或不同鹵原子之鹵烷基。特別佳係指具有1或2個碳原子及1至5個選自氟與氯所組成群中之相同或不同鹵原子之鹵烷基，如，特別指：二氟甲基、三氟甲基或2,2-二氟乙基。經鹵原子取代之化合物之其他實例為鹵烷氧基，如： OCF_3 、 OCHF_2 、 OCH_2F 、 OCF_2CF_3 、 OCH_2CF_3 、 OCH_2CHF_2 及 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ；鹵烷基氫硫基，如：二氟甲基硫、三氟甲基硫、三氯甲基硫、氯二氟甲基硫、1-氟乙基硫、2-氟乙基硫、2,2-二氟乙基硫、1,1,2,2-四氟乙基硫、2,2,2-三氟乙基硫或2-氯-1,1,2-三氟乙基硫；鹵烷基亞磺醯基，如：二氟甲基亞磺醯基、三氟甲基亞磺醯基、三氯甲基亞磺醯基、氯二氟甲基亞磺醯基、1-氟乙基亞磺醯基、2-氟乙基亞磺醯基、2,2-二氟乙基亞磺醯基、1,1,2,2-四氟乙基亞磺醯基、2,2,2-三氟乙基亞磺醯基及2-氯-1,1,2-三氟乙基亞磺醯基；鹵烷基磺醯基，如：二氟甲基磺醯基、三氟甲基磺醯基、三氯甲基磺醯基、氯二氟甲基磺醯基、1-氟乙基磺醯基、2-氟乙基磺醯基、2,2-二氟乙基磺醯基、1,1,2,2-四氟乙基磺醯基、2,2,2-三氟乙基磺醯基及2-氯-1,1,2-三氟乙基磺醯基。

【0057】 以具有碳原子之基團為例，較佳係指彼等具有1至4個碳原子，特別係1或2個碳原子者。較佳通常係指選自以下群中之取代基：鹵素(例如：氟及氯)、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ 烷基(較佳為甲基或乙基)、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ 鹵烷基(較佳為三氟甲基)、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ 烷氧

基(較佳為甲氧基或乙氧基)、(C₁-C₄)鹵烷基、硝基及氰基。此時特別佳係指甲基、甲氧基、氟及氯等取代基。

【0058】 經取代之胺基，如：單-或二取代之胺基意指來自經取代之胺基之群中之基團，其等係*N*-經取代，例如：經一個或兩個選自下列群中之相同或不同基團取代：烷基、羥基、胺基、烷氧基、醯基及芳基；較佳為*N*-單-及*N,N*-二烷基胺基(例如：甲基胺基、乙基胺基、*N,N*-二甲基胺基、*N,N*-二乙基胺基、*N,N*-二-正丙基胺基、*N,N*-二異丙基胺基或*N,N*-二丁基胺基)、*N*-單-或*N,N*-二烷氧基烷基胺基(例如：*N*-甲氧基甲基胺基、*N*-甲氧基乙基胺基、*N,N*-二(甲氧基甲基)胺基或*N,N*-二(甲氧基乙基)胺基)、*N*-單-及*N,N*-二芳基胺基，如：可視需要經取代之苯胺、醯基胺基、*N,N*-二醯基胺基、*N*-烷基-*N*-芳基胺基、*N*-烷基-*N*-醯基胺基及飽和 *N*-雜環；此時較佳係指具有1至4個碳原子之烷基；此時，芳基較佳為苯基或經取代之苯基；醯基適用於下文提出之定義，較佳為(C₁-C₄)-烷醯基。其同樣適用於經取代之羥基胺基或肼基。

【0059】 經取代之胺基亦包括氮原子上具有四個有機取代基之四級銨化合物(鹽類)。

【0060】 可視需要經取代之苯基較佳為未經取代或經單-或多取代之苯基，較佳為至多經三取代，其係經選自下列群中之相同或不同基團取代：鹵素、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)鹵烷氧基、(C₁-C₄)烷基硫、(C₁-C₄)鹵烷基硫、(C₁-C₄)烷基亞磺醯基 (C₁-C₄) 鹵烷基亞磺醯基、(C₁-C₄)烷基磺醯基 (C₁-C₄)鹵烷基磺醯基、氰基、異氰基及硝基，例如：鄰-、間-及對-甲苯基、二甲基苯基、2-、3-及4-氯苯基、2-、3-及4-氟苯基、2-、3-及4-三氟甲基-及4-三氯甲基苯基、2,4-、3,5-、2,5-及2,3-二氯苯基、鄰-、間-及對-甲氧基苯基、4-七氟苯基。

【0061】 可視需要經取代之環烷基較佳為未經取代或經單-或多取代之環烷基，較佳為至多經三取代，其係經選自下列所組成群中之相同或不同基團取代：鹵素、氰基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)

烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基及(C₁-C₄)鹵烷氧基，特別係經一個或兩個(C₁-C₄)烷基取代。

【0062】 本發明化合物可能產生較佳實施例。本文說明之個別實施例可以彼此組合。違反自然法則之組合並不包括在內，且習此相關技藝者因此依據其專業知識即可排除。例如：應排除具有三個或更多個相鄰氧原子之環結構式。

異構物

【0063】 式(I)化合物隨其取代基性質而定，可能呈幾何與/或光學活性異構物或不同組成之相應異構物混合物型式。此等立體異構物為例如：對映異構物、非對映異構物、滯轉異構物或幾何異構物。因此本發明包括純的立體異構物及此等異構物之任何混合物。

方法與用途

【0064】 本發明亦有關一種防治動物害蟲之方法，其中由式(I)化合物作用在動物害蟲與/或其棲息地上。動物害蟲之防治較佳係在農業與森林，及材料保護上進行。較佳係不包括人體或動物體之手術或治療之方法及在人體或動物體上進行之診斷方法。

【0065】 本發明進一步有關一種以式(I)化合物作為殺蟲劑，特定言之作物保護劑之用途。

【0066】 本申請案內容中，每一例之術語「殺蟲劑」亦總是包括術語「作物保護劑」。

【0067】 式(I)化合物具有良好之植物耐受性、對恆溫動物有利之毒性及良好之環境相容性，適合保護植物與植物器官來對抗生物性與非生物性逆境壓力因子，提高收成產量、改進收成材料品質、及防治動物害蟲，特別係出現在農業、園藝、動物畜養、水產養殖、森林、花園與休閒設施之昆蟲、蛛形類、蠕蟲，特定言之線蟲，及軟體動物，可用於保護庫存產品與材料，及用於衛生領域。

【0068】 本申請案內容中，術語「衛生」咸了解係指目的在於預防疾病(特定言之，傳染性疾病)及用於保護人類與動物健康及/或保護環境、及/或維持清潔之所有措施、過程與操作。根據本發明，其特別包括例如：紡織品或硬表面(特別係玻璃、木材、水泥、陶、瓷、塑膠或金屬(類)之表面)之清潔、消毒與殺菌之措施，以確保沒有衛生害蟲及/或其分泌物。本發明此態樣範圍較佳係不包括應用在人體或動物體之手術或治療過程，及在人體或動物體上進行之診斷方法。

【0069】 因此術語「衛生領域」涵蓋以此等衛生措施、過程與操作為重點之所有區域、技術領域與工業應用，例如：廚房、烘焙坊、機場、浴室、游泳池、購物中心、旅館、醫院、畜養棚、動物飼養，等等之衛生。

【0070】 因此術語「衛生害蟲」咸了解係指彼等出現在衛生領域中造成問題(特定言之，造成健康問題)之一或多種動物害蟲。因此其主要目的為在衛生領域中避免或達最低程度之衛生害蟲出現或與其接觸。尤其可透過施用殺蟲劑達成此點，其中製劑可同時用於預妨害蟲入侵及處理已存在之害蟲入侵。亦可能使用可避免或減少接觸到害蟲之製劑。衛生害蟲包括例如：下文述及之生物體。

【0071】 因此術語「衛生保護」涵蓋所有用於維持及/或改善此等衛生措施、過程與操作之作用。

【0072】 式(I)化合物較佳係作為殺蟲劑使用。其等有活性對抗正常敏感性與抗性物種，及對抗所有或某些發展階段。上述害蟲包括：

【0073】 節肢動物門(Arthropoda)，特定言之蛛形綱(Arachnida)之害蟲，例如：粗腳粉蟎屬(Acarus spp.)(例如：粉塵蟎(Acarus siro))、枸杞瘤節蟎(Aceria kuko)、桔瘤節蟎(Aceria sheldoni)、刺皮癭蟎屬(Aculops spp.)、刺癭蟎屬(Aculus spp.)(例如：福氏刺節蟎(Aculus fockeui)、蘋果銹蟎(Aculus schlechtendali))、花蟎屬(Amblyomma spp.)、橫紋葉蟎(Amphitetranychus viennensis)、銳緣蟎屬(Argas spp.)、牛蟎屬(Boophilus spp.)、紅鬚蟎屬(Brevipalpus spp.)(例如：紫紅短鬚蟎(Brevipalpus phoenicis))、禾草苔蟎(Bryobia graminum)、苜蓿苔蟎(Bryobia praetiosa)、刺尾蠍屬(Centruroides spp.)、恙蟎屬(Chorioptes spp.)、雞皮刺蟎

(*Dermanyssus gallinae*)、羽刺皮癬蟎(*Dermatophagoides pteronyssinus*)、美洲塵蟎(*Dermatophagoides farinae*)、革蜱屬(*Dermacentor* spp.)、始葉蟎屬(*Eotetranychus* spp.)(例如：核桃始葉蟎(*Eotetranychus hicoriae*))、梨上癭蟎(*Epitrimerus pyri*)、真葉蟎屬(*Eutetranychus* spp.)(例如：斑氏真葉蟎(*Eutetranychus banksi*))、癭蟎屬(*Eriophyes* spp.)(例如：梨癭蟎(*Eriophyes pyri*))、家食甜蟎(*Glycyphagus domesticus*)、足海鏟螯蟎(*Halotydeus destructor*)、半跗線蟎屬(*Hemitarsonemus* spp.)(例如：茶塵蟎(*Hemitarsonemus latus*))(=多食細蟎(*Polyphagotarsonemus latus*))、璃眼蜱屬(*Hyalomma* spp.)、硬蜱屬(*Ixodes* spp.)、球腹蛛屬(*Latrodectus* spp.)、褐隱蛛屬(*Loxosceles* spp.)、秋收恙蟎(*Neutrombicula autumnalis*)、Nuphresa屬、小爪蟎屬(*Oligonychus* spp.)(例如：咖啡小爪蟎(*Oligonychus coffee*)、針葉小爪蟎(*Oligonychus coniferarum*)、冬青小爪蟎(*Oligonychus ilicis*)、甘蔗小爪蟎(*Oligonychus indicus*)、芒果小爪蟎(*Oligonychus mangiferus*)、草地小爪蟎(*Oligonychus pratensis*)、石榴小爪蟎(*Oligonychus punicae*)、樟小爪蟎(*Oligonychus yothersi*))、鈍緣蜱屬(*Ornithodoros* spp.)、巨刺蟎屬(*Ornithonyssus* spp.)、紅蜘蛛屬(*Panonychus* spp.)(例如：桔全爪蟎(*Panonychus citri*))(=柑桔葉蟎(*Metatetranychus citri*))、榆全爪蟎(*Panonychus ulmi*)(=歐洲葉蟎(*Metatetranychus ulmi*)))、橘鏽蟎(*Phyllocoptruta oleivora*)、雜食葉蟎(*Platytetranychus multidigituli*)、多食細蟎(*Polyphagotarsonemus latus*)、癢蟎屬(*Psoroptes* spp.)、扇頭蜱屬(*Rhipicephalus* spp.)、根蟎屬(*Rhizoglyphus* spp.)、人疥蟎屬(*Sarcoptes* spp.)、蠍(*Scorpio maurus*)、狹跗線蟎屬(*Stenotarsonemus* spp.)、稻細蟎(*Steneotarsonemus spinki*)、細蟎屬(*Tarsonemus* spp.)(例如：亂跗線蟎(*Tarsonemus confusus*)、仙克萊細蟎(*Tarsonemus pallidus*))、紅葉蟎屬(*Tetranychus* spp.)(例如：加拿大葉蟎(*Tetranychus canadensis*)、赤葉蟎(*Tetranychus cinnabarinus*)、土耳其斯坦葉蟎(*Tetranychus turkestanii*)、二斑葉蟎(*Tetranychus urticae*))、秋蟎(*Trombicula alfreddugesi*)、蠍屬(*Vaejovis* spp.)、斜背瘤節蜱(*Vasates lycopersici*)；

唇足綱(Chilopoda)，例如：地蜈蚣屬(*Geophilus* spp.)、蚰蜒屬(*Scutigera* spp.)；

彈尾綱或彈尾目(Collembola)，例如：棘跳蟲(*Onychiurus armatus*)；綠圓跳蟲(*Sminthurus viridis*)；

重足綱(Diplopoda)，例如：具斑馬陸(*Blaniulus guttulatus*)；

昆蟲綱(Insecta)，例如：蜚蠊目(Blattodea)，例如：東方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、蜚蠊(*Blattella asahinai*)、德國蜚蠊(*Blattella germanica*)、馬得拉蜚蠊(*Leucophaea maderae*)、姬蜚蠊(*Loboptera decipiens*)、斑蠊(*Neostylopyga rhombifolia*)、古巴蜚蠊屬(*Panchlora* spp.)、帕科蜚蠊屬(*Parcoblatta* spp.)、家蠊屬(*Periplaneta* spp.)(例如：美洲家蠊(*Periplaneta americana*)、澳洲家蠊(*Periplaneta australasiae*))、蔗蠊(*Pycnoscelus surinamensis*)、長鬚帶蠊(*Supella longipalpa*)；

鞘翅目(Coleoptera)，例如：鑲邊黃瓜甲蟲(*Acalymma vittatum*)、大豆象(*Acanthoscelides obtectus*)、麗金龜屬(*Adoretus* spp.)、小蜂窩甲蟲(*Aethina tumida*)、赤楊紫跳甲(*Agelastica alni*)、瘦吉丁蟲屬(*Agrilus* spp.)(例如：光蠟瘦吉丁蟲(*Agrilus planipennis*)、瘦吉丁蟲(*Agrilus coxalis*)、栗雙線瘦吉丁蟲(*Agrilus bilineatus*)、樺桐瘦吉丁蟲(*Agrilus anxius*))、叩頭蟲屬(*Agriotes* spp.)(例如：具條叩甲(*Agriotes linneatus*)、小麥金針蟲(*Agriotes mancus*)、暗色叩甲(*Agriotes obscurus*))、外米擬步行蟲(*Alphitobius diaperinus*)、六月金龜子(*Amphimallon solstitialis*)、食骸蟲(*Anobium punctatum*)、銅金龜(*Anomala dubia*)、天牛屬(*Anoplophora* spp.)(例如：光肩星天牛(*Anoplophora glabripennis*))、棉鈴象甲屬(*Anthonomus* spp.)(例如：苜蓿葉象甲(*Anthonomus grandis*))、蠹屬(*Anthrenus* spp.)、梨象屬(*Apion* spp.)、甘蔗金龜屬(*Apogonia* spp.)、叩甲(*Athous haemorrhoidales*)、隱食甲屬(*Atomaria* spp.)(例如：甜菜隱食甲(*Atomaria linearis*))、小鰈節蟲屬

(*Attagenus* spp.)、象甲(*Baris caerulescens*)、豆象(*Bruchidius obtectus*)、豆象甲屬(*Bruchus* spp.)(例如：豌豆象甲(*Bruchus pisorum*)、蠶豆象甲(*Bruchus rufimanus*))、金花蟲屬(*Cassida* spp.)、大豆葉甲(*Cerotoma trifurcate*)、象甲屬(*Ceuthorrhynchus* spp.)(例如：甘藍莢象甲(*Ceutorrhynchus assimilis*)、藍籽莖象甲(*Ceutorrhynchus quadridens*)、油菜象甲(*Ceutorrhynchus rapae*))、小金花蟲屬(*Chaetocnema* spp.)(例如：甘薯金花蟲(*Chaetocnema confinis*)、具齒跳甲(*Chaetocnema denticulata*)、玉米跳甲(*Chaetocnema ectypa*))、牛蒡象甲(*Cleonus mendicus*)、金針蟲屬(*Conoderus* spp.)、球莖象甲屬(*Cosmopolites* spp.)(例如：香蕉球莖象甲(*Cosmopolites sordidus*))、蟬蟻(*Costelytra zealandica*)、叩頭蟲屬(*Ctenicera* spp.)、象甲屬(*Curculio* spp.)(例如：核桃象甲(*Curculio caryae*)、大栗象甲(*Curculio caryatrypes*)、榛子象甲(*Curculio obtusus*)、小栗象甲(*Curculio sayi*))、角胸粉扁蟲(*Cryptolestes ferrugineus*)、角胸扁蟲(*Cryptolestes pusillus*)、柳小隱喙象甲(*Cryptorhynchus lapathi*)、芒果象甲(*Cryptorhynchus mangiferae*)、莖象甲屬(*Cylindrocopturus* spp.)、密點細枝象甲(*Cylindrocopturus adspersus*)、黃杉枝象甲(*Cylindrocopturus furnissi*)、山松蟲屬(*Dendroctonus* spp.)(例如：龐德羅沙松小蠹蟲(*Dendroctonus ponderosae*))、皮蠹屬(*Dermestes* spp.)、葉甲屬(*Diabrotica* spp.)(例如：黃瓜條葉甲(*Diabrotica balteata*)、北方玉米根蟲(*Diabrotica barberi*)、南部玉米根蟲(*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、黃瓜十一星葉甲(*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*)、玉米根蟲(*Diabrotica virgifera virgifera*)、墨西哥玉米根蟲(*Diabrotica virgifera zea*))、蛀螟屬(*Dichocrocis* spp.)、水稻鐵甲蟲(*Dicladispa armigera*)、阿根廷兜蟲屬(*Diloboderus* spp.)、芽象甲屬(*Epicaerus* spp.)、瓢蟲屬(*Epilachna* spp.)(例如：南瓜瓢蟲(*Epilachna borealis*)、食植瓢蟲(*Epilachna varivestis*))、跳甲屬(*Epitrix* spp.)(例如：黃瓜跳甲(*Epitrix cucumeris*)、茄跳甲(*Epitrix fuscula*)、煙草跳甲(*Epitrix hirtipennis*)、馬鈴薯跳甲(*Epitrix subcrinita*)、塊莖跳甲(*Epitrix tuberis*))、鑽孔蟲屬(*Faustinus* spp.)、麥蛛甲(*Gibbium psylloides*)、闊角穀盜(*Gnathocerus cornutus*)、菜心螟(*Hellula undalis*)、白蟻蟻(*Heteronychus arator*)、天牛屬(*Heteronyx* spp.)、

長腳金龜(*Hoplia argentea*)、金龜子(*Hylamorphia elegans*)、象天牛(*Hylotrupes bajulus*)、苜蓿象甲(*Hypera postica*)、藍綠象(*Hypomeces squamosus*)、小蠹屬(*Hypothenemus* spp.)(例如：咖啡果小蠹(*Hypothenemus hampei*)、蘋枝小蠹(*Hypothenemus obscurus*)、果小蠹(*Hypothenemus pubescens*))、鰓角金龜(*Lachnosterna consanguinea*)、煙甲蟲(*Lasioderma serricorne*)、長首穀盜(*Latheticus oryzae*)、薪甲屬(*Lathridius* spp.)、負泥甲屬(*Lema* spp.)、馬鈴薯甲蟲(*Leptinotarsa decemlineata*)、潛葉蛾屬(*Leucoptera* spp.)(例如：咖啡潛葉蛾(*Leucoptera coffeella*))、金針蟲(*Limoniectypus*)、稻象甲(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、莖象甲屬(*Listronotus* (= *Hyperodes*) spp.)、黃象甲屬(*Lixus* spp.)、葉甲屬(*Luperodes* spp.)、黃胸葉甲(*Luperomorpha xanthodera*)、粉蠹屬(*Lyctus* spp.)、縊虎天牛屬(*Megacyllene* spp.)(例如：刺槐縊虎天牛(*Megacyllene robiniae*))、美洲葉甲屬(*Megascelis* spp.)、叩頭蟲屬(*Melanotus* spp.)(例如：奧勒岡州叩甲(*Melanotus longulus oregonensis*))、花粉甲(*Meligethes aeneus*)、吹粉金龜屬(*Melolontha* spp.)(例如：大栗鰓角金龜(*Melolontha melolontha*))、天牛屬(*Migdolus* spp.)、天牛屬(*Monochamus* spp.)、象甲(*Naupactus xanthographus*)、郭公蟲屬(*Necrobia* spp.)、新螢金花蟲屬(*Neogalerucella* spp.)、金黃蛛甲(*Niptus hololeucus*)、犀角金龜(*Oryctes rhinoceros*)、鋸胸粉扁蟲(*Oryzaephilus surinamensis*)、稻象甲(*Oryzaphagus oryzae*)、深溝象甲屬(*Otiorhynchus* spp.)(例如：蘋果白象甲(*Otiorhynchus cribricollis*)、苜蓿象甲(*Otiorhynchus ligustici*)、草莓根象甲(*Otiorhynchus ovatus*)、根象甲(*Otiorhynchus rugosostriatus*)、黑藤象甲(*Otiorhynchus sulcatus*))、負泥蟲屬(*Oulema* spp.)(例如：橙足負泥蟲(*Oulema melanopus*)、稻負泥蟲(*Oulema oryzae*))、銀點花金龜(*Oxycetonia jucunda*)、猿葉蟲(*Phaedon cochleariae*)、食葉蟲屬(*Phyllophaga* spp.)、鰓角金龜(*Phyllophaga helleri*)、葉蚤屬(*Phyllotreta* spp.)(例如：辣根跳甲(*Phyllotreta armoraciae*)、柔弱黑跳甲(*Phyllotreta pusilla*)、美條紋跳甲(*Phyllotreta ramosa*)、黃條葉蚤(*Phyllotreta striolata*))、日本麗金龜(*Popillia japonica*)、小象甲屬(*Premnotrypes* spp.)、大穀蠹(*Prostephanus truncatus*)、跳甲屬

(*Psylliodes* spp.)(例如：馬鈴薯跳甲(*Psylliodes affinis*)、油菜蘭跳甲(*Psylliodes chrysocephala*)、忽布跳甲(*Psylliodes punctulata*))、蛛甲屬(*Ptinus* spp.)、黑根瓢蟲(*Rhizobius ventralis*)、粉長蠹蟲(*Rhizopertha dominica*)、象鼻蟲屬(*Rhynchophorus* spp.)、椰子象鼻蟲(*Rhynchophorus ferrugineus*)、棕櫚象鼻蟲(*Rhynchophorus palmarum*)、小蠹屬(*Scolytus* spp.)(例如：歐洲大榆小蠹(*Scolytus multistriatus*))、雙棘長蠹蟲(*Sinoxylon perforans*)、米象屬(*Sitophilus* spp.)(例如：穀象(*Sitophilus granarius*)、羅望子象(*Sitophilus linearis*)、米象(*Sitophilus oryzae*)、玉米象(*Sitophilus zeamais*))、穀象屬(*Sphenophorus* spp.)、藥材甲蟲(*Stegobium paniceum*)、莖象屬(*Sternechus* spp.)(例如：豆莖象(*Sternechus paludatus*))、扁肩象屬(*Symphyletes* spp.)、象甲屬(*Tanymecus* spp.)(例如：玉米葉象(*Tanymecus dilaticollis*)、纖毛象(*Tanymecus indicus*)、紅豆草灰象甲(*Tanymecus palliatus*))、粉甲(*Tenebrio molitor*)、穀盜(*Tenebrioides mauretanicus*)、擬穀盜屬(*Tribolium* spp.)(例如：黑粉穀盜(*Tribolium audax*)、擬穀盜(*Tribolium castaneum*)、扁擬穀盜(*Tribolium confusum*))、鯉節蟲屬(*Trogoderma* spp.)、象甲屬(*Tychius* spp.)、虎天牛屬(*Xylotrechus* spp.)、步甲屬(*Zabrus* spp.)(例如：玉米步甲(*Zabrus tenebrioides*))；

革翅目 (Dermaptera)，例如：肥螞(Anisolabis maritime)、歐洲球螞(Forficula auricularia)、蠼螋(Labidura riparia)；

雙翅目(Diptera)，例如：伊蚊屬(*Aedes* spp.)(例如：埃及斑蚊(*Aedes aegypti*)、白線斑蚊(*Aedes albopictus*)、叮刺伊蚊(*Aedes sticticus*)、騷擾伊蚊(*Aedes vexans*))、潛蠅屬(*Agromyza* spp.)(例如：寬額斑潛蠅(*Agromyza frontella*)、美洲黍潛葉蠅(*Agromyza parvicornis*))、按實蠅屬(*Anastrepha* spp.)、按蚊屬(*Anopheles* spp.)(例如：四斑按蚊(*Anopheles quadrimaculatus*)、甘比亞瘧蚊(*Anopheles gambiae*))、癭蚊屬(*Asphondylia* spp.)、實蠅屬(*Bactrocera* spp.)(例如：瓜實蠅(*Bactrocera cucurbitae*)、東方果實蠅(*Bactrocera dorsalis*)、橄欖果蠅(*Bactrocera oleae*))、毛蚊

(*Bibio hortulanus*)、麗蠅(*Calliphora erythrocephala*)、紅頭麗蠅(*Calliphora vicina*)、地中海果實蠅(*Ceratitis capitata*)、搖蚊屬(*Chironomus* spp.) 金蠅屬(*Chrysomya* spp.)、斑虻屬(*Chrysops* spp.)、麻翅虻(*Chrysozona pluvialis*)、刺蚊屬(*Cochliomyia* spp.)、康癭蚊屬(*Contarinia* spp.)(例如：葡萄癭蚊(*Contarinia johnsoni*)、甘藍癭蚊(*Contarinia nasturtii*)、梨葉癭蚊(*Contarinia pyrivora*)、向日葵癭蚊(*Contarinia schulzi*)、高粱癭蚊(*Contarinia sorghicola*)、麥黃吸漿蟲(*Contarinia tritici*))、糞蠅(*Cordylobia anthropophaga*)、環足搖蚊(*Cricotopus sylvestris*)、庫蚊屬(*Culex* spp.)(例如：尖音庫蚊(*Culex pipiens*)、五帶淡色庫蚊(*Culex quinquefasciatus*))、庫蠓屬(*Culicoides* spp.)、脈毛蚊屬(*Culiseta* spp.)、疽蠅屬(*Cuterebra* spp.)、果蠅(*Dacus oleae*)、癭蚊屬(*Dasineura* spp.)(例如：油菜莢葉癭蚊(*Dasineura brassicae*))、地種蠅屬(*Delia* spp.)(例如：蔥地種蠅(*Delia antiqua*)、麥種蠅(*Delia coarctata*)、毛跗地種蠅(*Delia florilega*)、灰地種蠅(*Delia platura*)、甘藍地種蠅(*Delia radicum*))、人膚蠅(*Dermatobia hominis*)、猩猩蠅屬(*Drosophila* spp.)(例如：黑腹果蠅(*Drosophila melanogaster*)、鈴木果蠅(*Drosophila suzukii*))、象甲屬(*Echinocnemus* spp.)、芹菜尤列實蠅(*Euleia heraclei*)、廐蠅屬(*Fannia* spp.)、胃蠅屬(*Gastrophilus* spp.)、舌蠅屬(*Glossina* spp.)、麻虻屬(*Haematopota* spp.)、稻心蠅屬(*Hydrellia* spp.)、水稻潛葉蠅(*Hydrellia griseola*)、種蠅屬(*Hylemya* spp.)、虱蠅屬(*Hippobosca* spp.)、皮蠅屬(*Hypoderma* spp.)、潛蠅屬(*Liriomyza* spp.)(例如：白菜斑潛蠅(*Liriomyza brassicae*)、南美斑潛蠅(*Liriomyza huidobrensis*)、蔬菜斑潛蠅(*Liriomyza sativae*))、綠蠅屬(*Lucilia* spp.)(例如：絲光綠蠅(*Lucilia cuprina*))、羅蛉屬(*Lutzomyia* spp.)、沼蚊屬(*Mansonia* spp.)、家蠅屬(*Musca* spp.)(例如：家蠅(*Musca domestica*)、舍蠅(*Musca domestica vicina*))、狂蠅屬(*Oestrus* spp.)、瑞典蠅(*Oscinella frit*)、搖蚊屬(*Paratanytarsus* spp.)、搖蚊(*Paralauterborniella subcincta*)、潛蠅屬(*Pegomya* 或 *Pegomyia* spp.)(例如：甜菜潛蠅(*Pegomya betae*)、菠菜潛蠅(*Pegomya hyoscyami*)、懸鉤子潛蠅(*Pegomya rubivora*))、白蛉屬(*Phlebotomus* spp.)、蚤蠅屬(*Phorbia* spp.)、伏蠅屬(*Phormia* spp.)、酪蠅(*Piophilus casei*)、蘆筍實蠅(*Platyparea poeciloptera*)、

癭蚋屬(*Prodiplosis* spp.)、胡蘿蔔蠅(*Psila rosae*)、果實蠅屬(*Rhagoletis* spp.)(例如：北美櫻桃實蠅(*Rhagoletis cingulata*)、核桃繞實蠅(*Rhagoletis completa*)、黑櫻桃實蠅(*Rhagoletis fausta*)、歐洲甜櫻桃繞實蠅(*Rhagoletis indifferens*)、藍橘繞實蠅(*Rhagoletis mendax*)、蘋果果實蠅(*Rhagoletis pomonella*)、肉蠅屬(*Sarcophaga* spp.)、蚋屬(*Simulium* spp.)(例如：南方蚋(*Simulium meridionale*))、螫蠅屬(*Stomoxys* spp.)、虻屬(*Tabanus* spp.)、直斑蠅屬(*Tetanops* spp.)、大蚊屬(*Tipula* spp.)(例如：歐洲大蚊(*Tipula paludosa*)、牧場大蚊(*Tipula simplex*))、彎尾托實蠅(*Toxotrypana curvicauda*)；

半翅目(Hemiptera)，例如：金合歡昆木虱(*Acizzia acaciaebaileyanae*)、木虱(*Acizzia dodonaeae*)、木虱(*Acizzia uncatoides*)、長頭蝗(*Acrida turrita*)、無網長管蟲牙屬(*Acyrtosiphon* spp.)(例如：碗豆蚜(*Acyrtosiphon pisum*))、葉蟬屬(*Acrogonia* spp.)、*Aeneolamia* 屬、隆脈木虱屬(*Agonoscena* spp.)、蕙蘭粉虱屬(*Aleurocanthus* spp.)、歐洲甘藍粉虱(*Aleyrodes proletella*)、甘蔗穴粉虱(*Aleurolobus barodensis*)、棉絮粉虱(*Aleurothrixus floccosus*)、榴蓮被榴蓮木虱(*Allocaridara malayensis*)、果葉蝶屬(*Amrasca* spp.)(例如：二點小綠葉蟬(*Amrasca bigutulla*)、棉葉蟬(*Amrasca devastans*))、飛廉短尾蚜(*Anuraphis cardui*)、腎圓盾介殼蟲屬(*Aonidiella* spp.)(例如：橘紅腎圓盾介殼蟲(*Aonidiella aurantii*)、橘黃腎圓盾介殼蟲(*Aonidiella citrina*)、木瓜腎圓盾介殼蟲(*Aonidiella inornata*))、梨瘤蚜(*Aphanostigma piri*)、蚜蟲屬(*Aphis* spp.)(例如：橘捲菜蚜(*Aphis citricola*)、豆蚜(*Aphis craccivora*)、黑豆蚜(*Aphis fabae*)、草莓根蚜(*Aphis forbesi*)、大豆蚜(*Aphis glycines*)、棉蚜(*Aphis gossypii*)、常春藤蚜(*Aphis hederæ*)、葡萄蔓蚜(*Aphis illinoisensis*)、蚜蟲(*Aphis middletoni*)、鼠李馬鈴薯蚜(*Aphis nasturtii*)、夾竹桃蚜(*Aphis nerii*)、蘋果蚜(*Aphis pomi*)、繡線菊蚜(*Aphis spiraeicola*)、莢蒾蚜(*Aphis viburniphila*))、葡萄二星斑葉蟬(*Arboridia apicalis*)、木虱屬(*Arytainilla* spp.)、小圓盾蚧屬(*Aspidiella* spp.)、圓盾階屬(*Aspidiotus* spp.)(例如：夾竹桃圓蚧(*Aspidiotus nerii*))、*Atanus* 屬、馬鈴薯蚜

(*Aulacorthum solani*)、煙草粉虱(*Bemisia tabaci*)、芽木虱(*Blastopsylla occidentalis*)、茶樹蚜木虱(*Boreioglycaspis melaleucae*)、光管舌尾蚜(*Brachycaudus helichrysi*)、微管蟲牙屬(*Brachycolus* spp.)、菜蚜(*Brevicoryne brassicae*)、梨木虱屬(*Cacopsylla* spp.)(例如：梨黃木虱(*Cacopsylla pyricola*))、小褐稻虱(*Calligypona marginata*)、絮蚧屬(*Capulinia* spp.)、黃頭大葉蟬(*Carneocephala fulgida*)、甘蔗綿蚜(*Ceratovacuna lanigera*)、沫蟬科(*Cercopidae*)、角蠟蚧屬(*Ceroplastes* spp.)、草莓毛管蚜(*Chaetosiphon fragaefolii*)、蔗黃雪盾蚧(*Chionaspis tegalensis*)、茶小綠葉蟬(*Chlorita onukii*)、臺灣大蝗(*Chondracris rosea*)、核桃黑斑蚜(*Chromaphis juglandicola*)、褐圓蚧(*Chrysomphalus aonidum*)、柑橘褐圓蚧(*Chrysomphalus ficus*)、玉米葉蟬(*Cicadulina mbila*)、*Cocomytilus halli*、蚧屬(*Coccus* spp.)(例如：扁堅蚧(*Coccus hesperidum*)、長堅蚧(*Coccus longulus*)、桔軟蠟蟲介(*Coccus pseudomagnoliarum*)、黃綠蚧(*Coccus viridis*))、茶蔗隱瘤蚜(*Cryptomyzus ribis*)、*Cryptoneossa* 屬、梳木虱屬(*Ctenarytaina* spp.)、黃翅葉蜂屬(*Dalbulus* spp.)、裸粉虱(*Dialeurodes chittendeni*)、柑桔裸粉虱(*Dialeurodes citri*)、柑桔木虱(*Diaphorina citri*)、盾蚧屬(*Diaspis* spp.)、麥蚜屬(*Diuraphis* spp.)、*Doralis* 屬、草履蚧屬(*Drosicha* spp.)、莖蚜蟲屬(*Dysaphis* spp.)(例如：銹條蚜(*Dysaphis apiifolia*)、車前圓尾蚜(*Dysaphis plantaginea*)、鬱金香鱗莖蚜蟲(*Dysaphis tulipae*))、灰粉蚧屬(*Dysmicoccus* spp.)、小綠葉蟬屬(*Empoasca* spp.)(例如：馬鈴薯葉蟬(*Empoasca abrupta*)、馬鈴薯姬葉蟬(*Empoasca fabae*)、蘋果小綠葉蟬(*Empoasca maligna*)、茄微葉蟬(*Empoasca solana*)、史蒂芬氏葉蟬(*Empoasca stevensi*))、綿蚜屬(*Eriosoma* spp.)(例如：美國綿蚜(*Eriosoma americanum*)、蘋果綿蚜(*Eriosoma lanigerum*)、居梨綿蚜(*Eriosoma pyricola*))、斑葉蟬屬(*Erythroneura* spp.)、檸檬桉木虱屬(*Eucalyptolyma* spp.)、褐木虱屬(*Euphyllura* spp.)、鈍鼻葉蟬(*Euscelis bilobatus*)、拂粉蚧屬(*Ferrisia* spp.)、圍盾蚧屬(*Fiorinia* spp.)、盾蚧屬(*Furcaspis oceanica*)、咖啡粉蚧(*Geococcus coffeae*)、木虱屬(*Glycaspis* spp.)、銀合歡木虱(*Heteropsylla cubana*)、頰木虱(*Heteropsylla spinulosa*)、褐透翅尖頭大葉蟬(*Homalodisca*

coagulata)、桃大尾蚜(*Hyalopterus arundinis*)、桃粉蚜(*Hyalopterus pruni*)、吹綿蚜屬(*Icerya* spp.)(例如：吹綿蚜(*Icerya purchasi*))、片角葉蟬屬(*Idiocerus* spp.)、綠葉蟬屬(*Idioscopus* spp.)、灰飛虱(*Laodelphax striatellus*)、球蚜屬(*Lecanium* spp.)(例如：李蠟蚜(*Lecanium corni*) (= 褐盔蠟蚜(*Parthenolecanium corni*))、蠟盾蚜屬(*Lepidosaphes* spp.)(例如：榆蠟盾蚜(*Lepidosaphes ulmi*))、偽菜蚜(*Lipaphis erysimi*)、日本長片盾蚜(*Lopholeucaspis japonica*)、斑衣蠟蟬(*Lycorma delicatula*)、長管蚜屬(*Macrosiphum* spp.)(例如：馬鈴薯長管蚜(*Macrosiphum euphorbiae*)、長管蚜(*Macrosiphum lili*)、薔薇長管蚜(*Macrosiphum rosae*))、長針葉蟬(*Macrosteles facifrons*)、沫蝶屬(*Mahanarva* spp.)、黍蚜(*Melanaphis sacchari*)、Metcalfiella 屬、蛾蠟蟬(*Metcalfa pruinosa*)、麥無網蚜(*Metopolophium dirhodum*)、黑緣平翅斑蚜(*Monellia costalis*)、胡桃黑蚜(*Monelliopsis pecanis*)、桃蚜屬(*Myzus* spp.)(例如：冬蔥瘤額蚜(*Myzus ascalonicus*)、李瘤蚜(*Myzus cerasi*)、女貞瘤額蚜(*Myzus ligustri*)、莖菜瘤蚜(*Myzus ornatus*)、桃赤蚜(*Myzus persicae*)、煙草蚜(*Myzus nicotianae*))、萵苣蚜(*Nasonovia ribisnigri*)、粉蝨屬(*Neomaskellia* spp.)、黑尾葉蟬屬(*Nephotettix* spp.)(例如：偽黑尾葉蟬(*Nephotettix cincticeps*)、黑條黑尾葉蟬(*Nephotettix nigropictus*))、褐飛虱(*Nettigoniclla spectra*)、褐飛虱(*Nilaparvata lugens*)、Oncometopia 屬、旌蚜(*Orthezia praelonga*)、中華稻蝗(*Oxya chinensis*)、癭木虱屬(*Pachypsylla* spp.)、楊梅粉虱(*Parabemisia myricae*)、木虱屬(*Paratrioza* spp.)(例如：番茄木虱(*Paratrioza cockerelli*))、片盾蚜屬(*Parlatoria* spp.)、癭綿蚜屬(*Pemphigus* spp.)(例如：白楊癭綿蚜(*Pemphigus bursarius*)、多脈癭綿蚜(*Pemphigus populivenae*))、玉米飛虱(*Peregrinus maidis*)、扁角飛虱屬(*Perkinsiella* spp.)、粉蚜屬(*Phenacoccus* spp.)(例如：美地綿粉蚜(*Phenacoccus madeirensis*))、楊平翅棉蚜(*Phloeomyzus passerinii*)、瘤蚜(*Phorodon humuli*)、桃根蚜屬(*Phylloxera* spp.)(例如：核桃根瘤蚜(*Phylloxera devastatrix*)、警根瘤蚜(*Phylloxera notabilis*))、橘長盾蚜(*Pinnaspis aspidistrae*)、粉蚜屬(*Planococcus* spp.)(例如：柑桔粉蚜(*Planococcus citri*))、黃粉蚜(*Prosopidopsylla flava*)、梨形原棉蚜(*Protopulvinaria*

pyriformis)、桑白蚧(*Pseudaulacaspis pentagona*)、粉蚧屬(*Pseudococcus* spp.)(例如：柑桔棲粉蚧(*Pseudococcus calceolariae*)、康氏粉蚧(*Pseudococcus comstocki*)、長尾粉蚧(*Pseudococcus longispinus*)、葡萄粉蚧(*Pseudococcus maritimus*)、暗色粉蚧(*Pseudococcus viburni*))、*Psyllopsis* 屬、木虱屬(*Psylla* spp.)(例如：黃楊木虱(*Psylla buxi*)、蘋木虱(*Psylla mali*)、梨木虱(*Psylla pyri*))、金小蜂屬(*Pteromalus* spp.)、棉蚧屬(*Pulvinaria* spp.)、飛虱屬(*Pyrilla* spp.)、圓蚧屬(*Quadraspidotus* spp.)(例如：胡桃圓盾蚧(*Quadraspidotus juglansregiae*)、正楊笠圓盾蚧(*Quadraspidotus ostreaeformis*)、梨圓盾蚧(*Quadraspidotus perniciosus*))、*Quesada gigas*、粉蚧屬(*Rastrococcus* spp.)、頸狀蚜屬(*Rhopalosiphum* spp.)(例如：玉米蚜(*Rhopalosiphum maidis*)、縊管蚜(*Rhopalosiphum oxyacanthae*)、稻麥蚜(*Rhopalosiphum padi*)、紅腹縊管蚜(*Rhopalosiphum rufiabdominale*))、硬蚧屬(*Saissetia* spp.)(例如：咖啡硬蚧(*Saissetia coffeae*)、硬蚧(*Saissetia miranda*、*Saissetia neglecta*)、工脊硬蚧(*Saissetia oleae*))、蠟蚧(*Scaphoides titanus*)、麥二叉蚜(*Schizaphis graminum*)、盾蚧(*Selenaspidus articulatus*)、牛鞭草蚜(*Sipha flava*)、麥長管蚜(*Sitobion avenae*)、飛虱屬(*Sogatella* spp.)、白背飛虱(*Sogatella furcifera*)、飛虱屬(*Sogatodes* spp.)、沫蟬(*Stictocephala festina*)、樛粉虱(*Siphoninus phillyrae*)、聲蚜(*Tenalaphara malayensis*)、*Tetragonocephala* 屬、核桃黑蚜(*Tinocallis caryaefoliae*)、沫蟬屬(*Tomaspis* spp.)、二叉蚜屬(*Toxoptera* spp.)(例如：小桔蚜(*Toxoptera aurantii*)、大桔蚜(*Toxoptera citricidus*))、溫室粉虱(*Trialeurodes vaporariorum*)、木虱屬(*Trioza* spp.)(例如：棉木虱(*Trioza diospyri*))、紅閃小葉蟬屬(*Typhlocyba* spp.)、盾蚧屬(*Unaspis* spp.)、葡萄根瘤蚜(*Viteus vitifolii*)、斑點鋸蜂屬(*Zygina* spp.)；

異翅亞目(*Heteroptera*)，例如：麥蝽屬(*Aelia* spp.)、南瓜緣蝽(*Anasa tristis*)、芒果蝽屬(*Antestiopsis* spp.)、紅緣蝽屬(*Boisea* spp.)、麥長蝽屬(*Blissus* spp.)、盲蝽屬(*Calocoris* spp.)、盲蝽(*Campylomma livida*)、二尾蚜屬(*Cavelerius* spp.)、臭蟲屬(*Cimex* spp.)(例如：臭蟲(*Cimex adjunctus*)、熱帶臭蟲(*Cimex hemipterus*)、床蟲

(*Cimex lectularius*)、蝨臭蟲(*Cimex pilosellus*)、盲蝽屬(*Collaria* spp.)、盲蝽(*Creontiades dilutus*)、胡椒緣蝽(*Dasynus piperis*)、二葉喙蝽(*Dichelops furcatus*)、胡椒網蝽(*Diconocoris hewetti*)、蝽象屬(*Dysdercus* spp.)、臭蝽屬(*Euschistus* spp.)(例如：大豆褐蝽(*Euschistus heros*)、褐臭蝽(*Euschistus servus*)、暗淡蝽象(*Euschistus tristigmus*)、一點褐蝽(*Euschistus variolarius*))、菜蝽屬(*Eurydema* spp.)、刺蝽屬(*Eurygaster* spp.)、褐翅蝽象(*Halyomorpha halys*)、夜蛾屬(*Heliopeltis* spp.)、稻緣蝽(*Horcias nobilellus*)、豬緣蝽屬(*Leptocoris* spp.)、稻緣蝽象(*Leptocoris varicornis*)、西方針葉樹種子甲蟲(*Leptoglossus occidentalis*)、葉足緣蝽(*Leptoglossus phyllopus*)、麗盲蝽屬(*Lygocoris* spp.)(例如：原麗盲蝽(*Lygocoris pabulinus*))、盲蝽屬(*Lygus* spp.)(例如：豆莢灰盲蝽(*Lygus elisus*)、豆莢草盲蝽(*Lygus hesperus*)、美國牧草盲蝽(*Lygus lineolaris*))、蔗黑長蝽(*Macropes excavatus*)、豆龜蝽(*Megacopta cribraria*)、盲蝽科(*Miridae*)、金光綠盲蝽(*Monalonion atratum*)、綠蝽屬(*Nezara* spp.)(例如：南方綠蝽象(*Nezara viridula*))、小長蝽屬(*Nysius* spp.)、盾蝽屬(*Oebalus* spp.)、蝽科(*Pentomidae*)、擬配軍蟲(*Piesma quadrata*)、壁蝽屬(*Piezodorus* spp.)(例如：紅蝽(*Piezodorus guildinii*))、盲蝽屬(*Psallus* spp.)、駱梨盲蝽象(*Pseudacysta perseae*)、紅腹獵蝽屬(*Rhodnius* spp.)、可哥褐盲蝽(*Sahlbergella singularis*)、土蝽(*Scaptocoris castanea*)、稻黑蝽屬(*Scotinophora* spp.)、梨花網蝽(*Stephanitis nashi*)、臭蟲屬(*Tibraca* spp.)、椎蝽屬(*Triatoma* spp.)；

膜翅目(*Hymenoptera*)，例如：切葉蟻(*Acromyrmex* spp.)、葉蜂屬(*Athalia* spp.)(例如：紅角菜葉蜂(*Athalia rosae*))、切葉蟻屬(*Atta* spp.)、木蟻蟻屬(*Camponotus* spp.)、長黃胡蜂屬(*Dolichovespula* spp.)、松葉蜂屬(*Diprion* spp.)(例如：歐洲赤松葉蜂(*Diprion similis*))、葉蜂屬(*Hoplocampa* spp.)(例如：櫻實葉蜂(*Hoplocampa cookei*)、蘋果葉蜂(*Hoplocampa testudinea*))、蟻屬(*Lasius* spp.)、阿根廷蟻(*Linepithema* (*Iridomyrmex*) *humile*)、廚蟻(*Monomorium pharaonis*)、黃山蟻屬(*Paratrechina* spp.)、黃蜂屬(*Paravespula* spp.)、斜結蟻屬(*Plagiolepis* spp.)、樹蜂屬(*Sirex* spp.)(例如：

雲杉藍樹蜂(*Sirex noctilio*)、入侵紅火蟻(*Solenopsis invicta*)、酸臭蟻屬(*Tapinoma* spp.)、白足扁蟻(*Technomyrmex albipes*)、樹蜂(*Urocerus* spp.)、胡蜂屬(*Vespa* spp.)(例如：黃邊胡蜂(*Vespa crabro*))、小火蟻(*Wasmannia auropunctata*)、樹蜂屬(*Xeris* spp.)；

等足目(Isopoda)，例如：鼠婦(*Armadillidium vulgare*)、海蛆(*Oniscus asellus*)、球鼠婦(*Porcellio scaber*)；

等翅目(Isoptera)，例如：乳白蟻屬(*Coptotermes* spp.)(例如：台灣家白蟻(*Coptotermes formosanus*))、白蟻(*Cornitermes cumulans*)、堆砂白蟻屬(*Cryptotermes* spp.)、楹白蟻屬(*Incisitermes* spp.)、木白蟻屬(*Kaloterms* spp.)、甘蔗白蟻(*Microtermes obesi*)、象白蟻屬(*Nasutitermes* spp.)、土白蟻屬(*Odontotermes* spp.)、按白蟻屬(*Porotermes* spp.)、白蟻屬(*Reticulitermes* spp.)(例如：黃肢散白蟻(*Reticulitermes flavipes*)、西方犀白蟻(*Reticulitermes hesperus*))；

鱗翅目(Lepidoptera)，例如：小蠟蛾(*Achroia grisella*)、梁劍紋夜蛾(*Acronicta major*)、捲葉蛾屬(*Adoxophyes* spp.)(例如：小角紋捲葉蛾(*Adoxophyes orana*))、電紋夜蛾(*Aedia leucomelas*)、地老虎屬(*Agrotis* spp.)(例如：黃地老虎(*Agrotis segetum*)、小地老虎(*Agrotis ipsilon*))、波紋夜蛾屬(*Alabama* spp.)(例如：棉葉波紋夜蛾(*Alabama argillacea*))、蘋果蠹蛾(*Amyelois transitella*)、條麥蛾屬(*Anarsia* spp.)、夜蛾屬(*Anticarsia* spp.)(例如：大豆夜蛾(*Anticarsia gemmatilis*))、黃螟屬(*Argyroplote* spp.)、丫蚊夜蛾屬(*Autographa* spp.)、甘藍夜蛾(*Barathra brassicae*)、蘋果尖蛾(*Blastodacna atra*)、單帶弄蝶(*Borbo cinnara*)、棉葉穿孔潛蛾(*Bucculatrix thurberiella*)、松尺蠖(*Bupalus piniarius*)、夜蛾屬(*Busseola* spp.)、捲葉蛾屬(*Cacoecia* spp.)、茶細蛾(*Caloptilia theivora*)、煙捲葉蛾(*Capua reticulana*)、蘋果蠹蛾(*Carpocapsa pomonella*)、桃蛀果蛾(*Carposina niponensis*)、冬尺蛾(*Cheimatobia*

brumata)、螟屬(*Chilo* spp.)(例如：稻稈螟(*Chilo plejadellus*)、二化螟(*Chilo suppressalis*))、蘋果舞蛾(*Choreutis pariana*)、雲杉捲葉蛾屬(*Choristoneura* spp.)、金色雙斑蛾(*Chrysodeixis chalcites*)、葡萄果蠹蛾(*Clysia ambiguella*)、捲螟屬(*Cnaphalocerus* spp.)、稻縱捲葉野螟蛾(*Cnaphalocrocis medinalis*)、雲捲蛾屬(*Cnephasia* spp.)、細蛾屬(*Conopomorpha* spp.)、黑象甲屬(*Conotrachelus* spp.)、夜蛾屬(*Copitarsia* spp.)、小捲蛾屬(*Cydia* spp.)(例如：豆莢小捲蛾(*Cydia nigricana*)、蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella*))、夜蛾(*Dalaca noctuides*)、野螟屬(*Diaphania* spp.)、螟蛉屬(*Diparopsis* spp.)、小蔗螟(*Diatraea saccharalis*)、梢斑螟屬(*Dioryctria* spp.)(例如：梢斑螟(*Dioryctria zimmermani*))、埃及金剛鑽屬(*Earias* spp.)、柑橘果蛾(*Ecdytolopha aurantium*)、南美玉米苗斑螟(*Elasmopalpus lignosellus*)、非洲莖螟(*Eldana saccharina*)、粉螟屬(*Ephestia* spp.)(例如：煙草粉螟(*Ephestia elutella*)、地中海斑螟(*Ephestia kuehniella*))、小捲蛾屬(*Epinotia* spp.)、蘋果飛蛾(*Epiphyas postvittana*)、尺蛾屬(*Erannis* spp.)、皮夜蛾(*Erschoviella musculana*)、螟蛾屬(*Etiella* spp.)、木葉蛾屬(*Eudocima* spp.)、巧言蟲屬(*Eulia* spp.)、環針單紋捲蛾(*Eupoecilia ambiguella*)、毒蛾屬(*Euproctis* spp.)(例如：棕尾毒蛾(*Euproctis chrysorrhoea*))、切根蟲屬(*Euxoa* spp.)、褐夜蛾屬(*Feltia* spp.)、大蠟螟(*Galleria mellonella*)、潛葉細蛾屬(*Gracillaria* spp.)、小食心蟲屬(*Grapholitha* spp.)(例如：桃折心蟲(*Grapholita molesta*)、蘋果小果蠹(*Grapholita prunivora*))、螟蛾屬(*Hedylepta* spp.)、夜蛾屬(*Helicoverpa* spp.)(例如：番茄夜蛾(*Helicoverpa armigera*)、玉米夜蛾(*Helicoverpa zea*))、棉鈴蟲屬(*Heliothis* spp.)(例如：綠棉鈴蟲(*Heliothis virescens*))、蝠蛾屬(*Hepialus* spp.)(例如：紅白蝠蛾(*Hepialus humuli*))、褐織夜蛾(*Hofmannophila pseudospretella*)、斑螟屬(*Homoeosoma* spp.)、捲葉蛾屬(*Homona* spp.)、櫻桃巢蛾(*Hyponomeuta padella*)、柿食心蟲(*Kakivoria flavofasciata*)、灰蝶屬(*Lampides* spp.)、黏蟲屬(*Laphygma* spp.)、梨小食心蟲(*Laspeyresia molesta*)、茄黃斑螟(*Leucinodes orbonalis*)、潛葉蛾屬(*Leucoptera* spp.)(例如：咖啡潛葉蛾(*Leucoptera coffeella*))、細蛾屬(*Lithocolletis* spp.)(例如：斑幕潛葉蛾(*Lithocolletis blancardella*)、綠果夜蛾

(*Lithophane antennata*))、捲蛾屬(*Lobesia* spp.)(例如：葡萄莓果飛蛾(*Lobesia botrana*))、豆白緣切根蟲(*Loxagrotis albicosta*)、毒蛾屬(*Lymantria* spp.)(例如：舞毒蛾(*Lymantria dispar*))、萊氏蛾屬(*Lyonetia* spp.)(例如：桃潛葉蛾(*Lyonetia clerkella*))、金龜(*Malacosoma neustria*)、豆莢螟(*Maruca testulalis*)、甘藍夜蛾(*Mamestra brassicae*)、暮眼蝶(*Melanitis leda*)、莖夜蛾屬(*Mocis* spp.)、穀蛾科(*Monopis obviella*)、東方黏蟲(*Mythimna separate*)、穀蛾(*Nemapogon cloacellus*)、水螟屬(*Nymphula* spp.)、扇頭蜉屬(*Oiketicus* spp.)、螟蛾屬(*Omphisa* spp.)、秋尺蛾屬(*Operophtera* spp.)、夜蛾屬(*Oria* spp.)、螟蛾屬(*Orthaga* spp.)、玉米螟屬(*Ostrinia* spp.)(例如：歐洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis*))、小眼夜蛾(*Panolis flammea*)、弄蝶屬(*Parnara* spp.)、紅鈴蟲屬(*Pectinophora* spp.)(例如：棉紅鈴蟲(*Pectinophora gossypiella*))、潛葉蛾屬(*Perileucoptera* spp.)、蠹蛾屬(*Phthorimaea* spp.)(例如：馬鈴薯塊莖蛾(*Phthorimaea operculella*))、橘葉潛蛾(*Phyllocnistis citrella*)、細蛾屬(*Phyllonorycter* spp.)(例如：斑幕潛葉(*Phyllonorycter blancardella*)、山楂潛葉蛾(*Phyllonorycter crataegella*))、粉蝶屬(*Pieris* spp.)(例如：紋白蝶(*Pieris rapae*))、荷蘭石竹小捲蛾(*Platynota stultana*)、印度穀斑螟(*Plodia interpunctella*)、擬尺蠖屬(*Plusia* spp.)、小菜蛾(*Plutella xylostella*) (=小菜蛾(*Plutella maculipennis*))、鑽空蟲屬(*Podesia* spp.)(例如：紫丁香鑽空蟲(*Podesia syringae*))、巢蛾屬(*Prays* spp.)、夜盜蛾屬(*Prodenia* spp.)、天蛾屬(*Protoparce* spp.)、黏蟲屬(*Pseudaletia* spp.)(例如：星黏蟲(*Pseudaletia unipuncta*))、大豆夜蛾(*Pseudoplusia includens*)、野螟(*Pyrausta nubilalis*)、薄荷灰夜蛾(*Rachiplusia nu*)、三化螟屬(*Schoenobius* spp.)(例如：三化螟(*Schoenobius bipunctifer*))、白禾螟蛾屬(*Scirpophaga* spp.)(例如：稻白螟(*Scirpophaga innotata*))、黃地老虎(*Scotia segetum*)、蛀莖夜蛾屬(*Sesamia* spp.)(例如：稻蛀莖夜蛾(*Sesamia inferens*))、捲葉蛾屬(*Sparganothis* spp.)、斜紋夜蛾屬(*Spodoptera* spp.)(例如：斜紋夜蛾(*Spodoptera eradiana*)、甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua*)、草地斜紋夜蛾(*Spodoptera frugiperda*)、灰翅夜蛾(*Spodoptera praefica*))、舉肢蛾屬(*Stathmopoda* spp.)、織蛾屬(*Stenoma* spp.)、潛葉蟲(*Stomopteryx*

subsecivella)、透翅蛾屬(*Synanthedon* spp.)、馬鈴薯塊莖蛾(*Tecia solanivora*)、松舟蛾屬(*Thaumetopoea* spp.)、幹煞夜蛾(*Thermesia gemmatilis*)、軟木長角蛾(*Tinea cloacella*)、網衣蛾(*Tinea pellionella*)、袋穀蛾(*Tineola bisselliella*)、櫟綠捲葉蛾屬(*Tortrix* spp.)、毛氈衣蛾(*Trichophaga tapetzella*)、夜蛾屬(*Trichoplusia* spp.)(例如：粉紋夜蛾(*Trichoplusia ni*))、三化螟(*Tryporyza incertulas*)、番茄斑潛蠅(*Tuta absoluta*)、小灰蝶屬(*Virachola* spp.)；

直翅目(*Orthoptera*)或跳躍亞目(*Saltatoria*)，例如：家蟋蟀(*Acheta domesticus*)、草蜢屬(*Dichroplus* spp.)、螻蛄屬(*Gryllotalpa* spp.)(例如：歐洲螻蛄(*Gryllotalpa gryllotalpa*))、蔗蝗屬(*Hieroglyphus* spp.)、飛蝗屬(*Locusta* spp.)(例如：東亞飛蝗(*Locusta migratoria*))、負蝗屬(*Melanoplus* spp.)(例如：赤地蚱蜢(*Melanoplus devastator*))、烏蘇裏擬寰蝽(*Paratlanticus ussuriensis*)、群居蚱蜢(*Schistocerca gregaria*)；

毛蟲目(*Phthiraptera*)，例如：毛蟲屬(*Damalinia* spp.)、豬蟲屬(*Haematopinus* spp.)、犬蟲屬(*Linognathus* spp.)、人蟲屬(*Pediculus* spp.)、長角羽蟲(*Phylloxera vastatrix*)、陰蟲(*Phthirus pubis*)、獸鳥蟲屬(*Trichodectes* spp.)；

嚙蟲目(*Psocoptera*)，例如：嚙蟲屬(*Lepinotus* spp.)、書蟲屬(*Liposcelis* spp.)；

蚤目(*Siphonaptera*)，例如：鼠蚤屬(*Ceratophyllus* spp.)、櫛頭蚤屬(*Ctenocephalides* spp.)(例如：狗櫛頭蚤(*Ctenocephalides canis*)、貓櫛頭蚤(*Ctenocephalides felis*))、人蚤(*Pulex irritans*)、穿皮潛蚤(*Tunga penetrans*)、東方鼠蚤(*Xenopsylla cheopis*)；

縷翅目(*Thysanoptera*)，例如：玉米黃薊馬(*Anaphothrips obscurus*)、稻薊馬(*Baliothrips biformis*)、中斑圍孔薊馬(*Chaetanaphothrips leeuweni*)、葡萄德薊馬

(*Drepanothrips reuteri*)、黃帶薊馬(*Enneothrips flavens*)、花薊馬屬(*Frankliniella* spp.)(例如：煙褐花薊馬(*Frankliniella fusca*)、西方花薊馬(*Frankliniella occidentalis*)、梳缺花薊馬(*Frankliniella schultzei*)、麥花薊馬(*Frankliniella tritici*)、越桔花薊馬(*Frankliniella vaccinii*)、威廉期花薊馬(*Frankliniella williamsi*))、正皮薊馬屬(*Haplothrips* spp.)、網薊馬屬(*Heliothrips* spp.)、溫室條籬薊馬(*Hercinothrips femoralis*)、卡薊馬屬(*Kakothrips* spp.)、葡萄薊馬(*Rhipiphorothrips cruentatus*)、硬薊馬屬(*Scirtothrips* spp.)、薊馬(*Taeniothrips cardamomi*)、薊馬屬(*Thrips* spp.)(例如：南黃薊馬(*Thrips palmi*)、蔥薊馬(*Thrips tabaci*))；

纓尾目(*Zygentoma*)(=總尾目(*Thysanura*))，例如：櫛衣魚屬(*Ctenolepisma* spp.)、西洋衣魚(*Lepisma saccharina*)、盜火蟲(*Lepismodes inquilinus*)、斑衣魚(*Thermobia domestica*)；

結合綱(*Symphyla*)，例如：蚰蜒屬(*Scutigera* spp.)，例如：白松蟲(*Scutigera immaculata*)；

軟體動物門(*Mollusca*)，例如：雙殼綱(*Bivalvia*)之害蟲，例如：飾貝屬(*Dreissena* spp.)；

及腹足綱(*Gastropoda*)，例如：蛞蝓屬(*Arion* spp.)(例如：紅蛞蝓(*Arion ater rufus*))、紅扁蝸屬(*Biomphalaria* spp.)、泡螺屬(*Bulinus* spp.)、灰蛞蝓屬(*Deroceras* spp.)(例如：黏液蛞蝓(*Deroceras leae*))、土蝸螺屬(*Galba* spp.)、椎實螺屬(*Lymnaea* spp.)、釘螺屬(*Oncomelania* spp.)、福壽螺屬(*Pomacea* spp.)、琥珀螺屬(*Succinea* spp.)；

來自線蟲動物門(*Nematoda*)之植物害蟲，亦即植物寄生性線蟲，特定言之：墊刃線蟲屬(*Aglenchus* spp.)(例如：居農野外墊刃線蟲(*Aglenchus agricola*))、粒癭線蟲

屬 (*Anguina* spp.)(例如：小麥粒癭線蟲(*Anguina tritici*))、滑刃線蟲屬 (*Aphelenchoides* spp.)(例如：花生滑刃線蟲(*Aphelenchoides arachidis*)、葉芽滑刃線蟲(*Aphelenchoides fragariae*))、刺線蟲屬(*Belonolaimus* spp.)(例如：豌豆刺線蟲(*Belonolaimus gracilis*)、長尾刺線蟲(*Belonolaimus longicaudatus*)、諾頓刺線蟲(*Belonolaimus nortoni*))、傘滑刃線蟲屬(*Bursaphelenchus* spp.)(例如：椰子紅環腐線蟲(*Bursaphelenchus cocophilus*)、傘滑刃線蟲(*Bursaphelenchus eremus*)、松材線蟲(*Bursaphelenchus xylophilus*))、固著線蟲屬(*Cacopaurus* spp.)(例如：波斯固著線蟲(*Cacopaurus pestis*))、環紋線蟲屬(*Criconemella* spp.)(例如：彎曲環紋線蟲(*Criconemella curvata*)、環紋線蟲(*Criconemella onoensis*)、裝飾環紋線蟲(*Criconemella ornata*)、環紋線蟲(*Criconemella rusium*)、葡萄環紋線蟲(*Criconemella xenoplax*) (= 環腐線蟲(*Mesocriconema xenoplax*))、小環線蟲屬(*Criconemoides* spp.)(例如：弗尼亞小環線蟲(*Criconemoides ferniae*)、小環線蟲(*Criconemoides onoense*)、杯口小環線蟲(*Criconemoides ornatum*))、莖囊線蟲(*Ditylenchus* spp.)(例如：莖線蟲(*Ditylenchus dipsaci*))、錐線蟲屬(*Dolichodorus* spp.)、包囊線蟲屬(*Globodera* spp.)(例如：馬鈴薯白線蟲(*Globodera pallida*)、黃色馬鈴薯包囊線蟲(*Globodera rostochiensis*))、螺旋線蟲屬(*Helicotylenchus* spp.)(例如：雙宮螺旋線蟲(*Helicotylenchus dihystera*))、半鞘線蟲屬(*Hemicriconemoides* spp.)、鞘線蟲屬(*Hemicyclophora* spp.)、異皮線蟲屬(*Heterodera* spp.)(例如：禾穀異皮線蟲(*Heterodera avenae*)、大豆異皮線蟲(*Heterodera glycines*)、甜菜異皮線蟲(*Heterodera schachtii*))、穿根線蟲屬(*Hirschmaniella* spp.)、紐帶線蟲屬(*Hoplolaimus* spp.)、長刺線蟲屬(*Longidorus* spp.)(例如：非洲長刺線蟲(*Longidorus africanus*))、根瘤線蟲屬(*Meloidogyne* spp.)(例如：奇特伍德根瘤線蟲(*Meloidogyne chitwoodi*)、法克斯根瘤線蟲(*Meloidogyne fallax*)、北方根瘤線蟲(*Meloidogyne hapla*)、南方根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*))、根瘤線蟲屬(*Meloinema* spp.)、假根瘤線蟲屬(*Nacobbus* spp.)、擬莖線蟲屬(*Neotylenchus* spp.)、殘根線蟲屬(*Paralongidorus* spp.)、擬滑刃

線蟲屬(*Paraphelenchus* spp.)、擬毛刺線蟲屬(*Paratrichodorus* spp.)(例如：微小擬毛刺線蟲(*Paratrichodorus minor*))、釘線蟲屬(*Paratylenchus* spp.)、短體線蟲屬(*Pratylenchus* spp.)(例如：穿刺短體線蟲(*Pratylenchus penetrans*))、假海矛線蟲屬(*Pseudohalenchus* spp.)、平滑墊刃線蟲屬(*Psilenchus* spp.)、胞囊線蟲屬(*Punctodera* spp.)、溝線蟲屬(*Quinisulcius* spp.)、穿孔線蟲屬(*Radopholus* spp.)(例如：柑橘穿孔線蟲(*Radopholus citrophilus*)、香蕉穿孔線蟲(*Radopholus similis*))、腎狀線蟲屬(*Rotylenchulus* spp.)、盤旋線蟲屬(*Rotylenchus* spp.)、螺旋線蟲屬(*Scutellonema* spp.)、粒線蟲屬(*Subanguina* spp.)、毛刺線蟲屬(*Trichodorus* spp.)(例如：鈍毛刺線蟲(*Trichodorus obtusus*)、原始毛刺線蟲(*Trichodorus primitivus*))、矮化線蟲屬(*Tylenchorhynchus* spp.)(例如：飾環矮化線蟲(*Tylenchorhynchus annulatus*))、半穿刺線蟲屬(*Tylenchulus* spp.)(例如：柑橘半穿刺線蟲(*Tylenchulus semipenetrans*))、劍線蟲屬(*Xiphinema* spp.)(例如：標準劍線蟲(*Xiphinema index*))。

【0074】 式(I)化合物在某些濃度或施用率下，亦可視需要作為除草劑、安全劑、生長調節劑或改善植物性質之製劑、或作為殺微生物劑或殺配子劑使用，例如：殺真菌劑、抗黴菌劑、殺細菌劑、殺病毒劑(包括對抗類病毒之製劑)或作為對抗MLO(似黴漿菌生物體)與RLO(似立克次體生物體)之製劑。若適當時，其亦可作為合成其他活性化合物之中間物或前體使用。

調配物/使用型式

【0075】 本發明進一步有關一種調配物，特定言之供防治不要之動物害蟲之調配物。該調配物可以施用在動物害蟲及/或其棲息地上。

【0076】 本發明調配物可呈「現成」使用型式提供給終端用戶，亦即調配物可以利用合適裝置(如：噴灑或灑粉裝置)直接施用至植物或種子。或者，調配物可呈濃縮劑形式提供給終端用戶，其在使用前必需先稀釋，較佳係加水稀釋。

除非另有說明，否則「調配物」用語因此係指此等濃縮劑，而「使用型式」用語係指呈「現成」溶液提供給終端用戶，亦即通常指此等已稀釋調配物。

【0077】 本發明調配物可依習知方式製備，例如：混合本發明化合物與一或多種合適輔劑，如本文所揭示之輔劑。

【0078】 調配物包含至少一種本發明化合物及至少一種農業上合適之輔劑，例如：載劑及/或界面活性劑。

【0079】 載劑為固態或液態、天然或合成、有機或無機之通常呈惰性之物質。載劑通常會改善化合物在例如：植物、植株部份或種子上之施用性。合適之固態載劑實例包括(但不限於)：銨鹽(特定言之硫酸銨、磷酸銨、及硝酸銨)、天然礦物粉末(如：高嶺土、黏土、滑石、白堊、石英、矽鎂土、蒙脫土與矽藻土)、及合成礦物粉末(如：高分散度矽石、氧化鋁與矽酸鹽)。通常適用於製備粒劑之固態載劑實例包括(但不限於)：粉碎與分碎天然礦石(如：方解石、大理石、浮石、海泡石、與白雲石)、無機與有機粉末之合成顆粒、及有機材料之顆粒(如：紙、鋸屑、椰子殼、玉米穗軸、及菸草桿)。合適之液態載劑實例包括(但不限於)：水、有機溶劑及其組合。合適之溶劑實例包括極性與非極性有機化學液體，例如：來自芳香烴及非芳香烴類(如：環己烷、石蠟、烷基苯、二甲苯、甲苯、四氫萘、烷基萘、氯化芳香烴或氯化脂系烴，如：氯苯、氯乙烯或二氯甲烷)、醇類與多元醇(其亦可視需要經取代、醚化及/或酯化，如：乙醇、丙醇、丁醇、苯甲基醇、環己醇、或甘醇)、酮類(如：丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁基酮、乙醯苯、或環己酮)、酯類(包括脂肪與油類)及(聚)醚類、未經取代與經取代之胺類、醯胺類(如：二甲基甲醯胺或脂肪酸醯胺)與其酯類、內醯胺類(如：N-烷基吡咯啉酮，特定言之N-甲基吡咯啉酮)與內酯類、礬類與亞礬類(如：二甲亞礬)、植物性或動物性油類、腈類(烷基腈類，如：乙腈、丙腈、丁腈，或芳香腈類，如：苯甲腈)、碳酸酯類(環狀碳酸酯類，如：仲乙基碳酸酯、仲丙基碳酸酯、仲丁基碳酸酯，或碳酸二烷基酯，如：碳酸二甲基酯、碳酸二乙基酯、碳酸二丙基酯、碳酸二丁基酯、碳酸二辛基酯)。載劑亦可為液化氣體補充劑，亦即在標準溫度

及標準壓力下呈氣態之液體，例如：氣霧劑推進劑，如：鹵烴類、丁烷、丙烷、氮氣與二氧化碳。

【0080】 較佳固態載劑係選自黏土、滑石、與矽石。

【0081】 較佳液態載劑係選自：水、脂肪酸醯胺及其酯類、芳香系與非芳香系烴類、內醯胺、內酯、碳酸酯類、酮類、(聚)醚類。

【0082】 載劑含量通常佔調配物重量之1至99.99%之範圍內，較佳為5至99.9%，更佳為10至99.5%，及最佳為20至99%。

【0083】 液態載劑含量通常佔調配物重量之20至90%之範圍內，例如：30至80%。

【0084】 固態載劑含量通常佔調配物重量之0至50%之範圍內，較佳為5至45%，例如：10至30%。

【0085】 若調配物包含兩種或多種載劑時，所出示之範圍係指載劑之總量。

【0086】 界面活性劑可為離子性(陽離子性或陰離子性)、兩性離子性、或非離子性界面活性劑，如：離子性或非離子性乳化劑、泡沫形成劑、勻散劑、濕化劑、滲透加強劑、及其任何混合物。合適界面活性劑實例包括(但不限於)：聚丙烯酸之鹽類、乙氧基化聚(α -取代)丙烯酸酯衍生物、木質素磺酸之鹽類(如：木質素磺酸鈉)、苯酚磺酸或萘磺酸之鹽類、環氧乙烷及/或氧化丙烯與/或不與醇類、脂肪酸、或脂肪胺之聚縮合物(聚氧乙烯脂肪酸酯類，如：蓖麻油乙氧化物、聚氧乙烯脂肪醇醚類，例如：烷基芳基聚二醇醚類)、經取代之苯酚類(較佳係烷基酚或芳基酚)、磺代琥珀酸酯之鹽類、牛磺酸衍生物(較佳係牛磺酸烷基酯)、聚乙氧基化醇或苯酚之磷酸酯、多元醇之脂肪酯(如：甘油、山梨糖醇或蔗糖之脂肪酸酯)、硫酸酯(如：硫酸烷基酯及烷基醚硫酸酯)、磺酸酯(例如：烷基磺酸酯、芳基磺酸酯及烷基苯磺酸酯)、萘/甲醛之磺酸化聚合物、磷酸酯、蛋白質水解物、木質素亞硫酸鹽廢液、及甲基纖維素。此段落所提及之任何鹽類較佳係指各鹼金屬、鹼土金屬及銨鹽。

【0087】 較佳界面活性劑係選自：乙氧基化聚(α -經取代)丙烯酸酯衍生物、環氧乙烷及/或氧化丙烯與醇類之聚縮合物、聚氧乙烯脂肪酸酯、烷基苯磺酸酯、萘/甲醛之磺酸化聚合物、聚氧乙烯脂肪酸酯(如：蓖麻油乙氧化物)、木質素磺酸鈉、及芳基酚乙氧化物。

【0088】 界面活性劑之用量通常佔調配物重量之5至40%之範圍內，例如：10至20%。

【0089】 合適輔劑之其他實例包括：防潑水劑、乾燥劑、結合劑(黏著劑、膠黏劑、固定劑，如：羧甲基纖維素、天然與合成粉狀、粒狀或似膠乳狀聚合物，如：阿拉伯膠、聚乙烯醇與聚乙酸乙烯酯、天然磷脂類，如：腦磷脂與卵磷脂，及合成之磷脂類、聚乙烯吡咯啉酮、及纖基乙酸鈉(tylose))、增稠劑及二次增稠劑(如：纖維素醚類、丙烯酸衍生物、黃原膠、改質黏土，例如：名稱為Bentone之產品，及高分散度矽石)、安定劑(例如：低溫安定劑、防腐劑(例如：二氯吩(dichlorophen)、苯甲醇半縮甲醛、1,2-苯并異噻唑啉-3-酮、2-甲基-4-異噻唑啉-3-酮)、抗氧化劑、光安定劑，特定言之UV安定劑，或其他改善化學/物理安定性之製劑)、染劑或色素(如：無機色素，例如：氧化鐵，氧化鈦與普魯士藍(Prussian Blue)；有機染劑，例如：茜素、偶氮與金屬酞花青染劑)、消泡劑(例如：聚矽氧消泡劑與硬脂酸鎂)、防凍劑、黏合劑、赤霉素、及加工輔劑、礦物性與植物性油類、香料、蠟類、營養素(包括微量營養素，如：鐵、錳、硼、銅、鈷、鋁與鋅之鹽類)、保護性膠體、搖變物質、滲透劑、螯合劑及錯化物形成劑。

【0090】 輔劑的選擇係與本發明化合物之計畫施用模式及/或化合物之物理性質相關。此外，可選擇會為調配物或其所製成施用形式賦與特殊性質(技術、物理與/或生物性質)之輔劑。選擇輔劑可以讓該調配物針對特定需求客製化。

【0091】 調配物包含殺昆蟲/殺蟬蟎/殺線蟲有效量之本發明化合物。術語「有效量」係指在栽種之植物上或在保護材料時，足以防治有害昆蟲/蟎類/線蟲，同時不會對接受處理之植物造成顯著傷害時之用量。此等用量可能在相當大範圍內變化，且依各種不同因素變化，如：所防治之昆蟲/蟎類/線蟲物種、所處理之

栽種植物或材料、氣候條件及所使用之本發明特定化合物。通常，根據本發明調配物包含0.01至99%重量比，較佳為0.05至98%重量比，更佳為0.1至95%重量比，甚至更佳為0.5至90%重量比，最佳為1至80%重量比之本發明化合物。調配物可能包含兩種或更多種本發明化合物。此時，所出示之範圍係指本發明化合物之總量。

【0092】 本發明調配物可呈任何慣用調配物型式，如：溶液(例如：水溶液)、乳液、水性與油性懸浮液、粉劑(例如：可濕性粉劑、可溶性粉劑)、塵粉劑、糊劑、粒劑(例如：可溶性粒劑、撒播用粒劑)、濃懸乳劑、浸飽本發明化合物之天然或合成性產品、肥料及含於聚合性物質中之微囊封物。本發明化合物可呈懸浮、乳化、或溶解型式。特別合適之調配物型式實例為溶液、水溶性濃縮劑(例如：SL、LS)、勻散性濃縮劑(DC)、懸浮液及懸浮濃縮劑(例如：SC、OD、OF、FS)、可乳化濃縮劑(例如：EC)、乳液(例如：EW、EO、ES、ME、SE)、膠囊(例如：CS、ZC)、糊劑、片劑、可濕性粉劑或塵粉劑(例如：WP、SP、WS、DP、DS)、壓餅(pressings)(例如：BR、TB、DT)、粒劑(例如：WG、SG、GR、FG、GG、MG)、殺昆蟲物品(例如：LN)、及用於處理植物繁殖材料(如：種子)之凝膠調配物(例如：GW、GF)。此等及其他調配物型式係由聯合國農糧組織(Food and Agriculture Organization of the United Nations(FAO))所定義。其概述可參見2008年5月之第6版「Catalogue of pesticide formulation types and international coding system, Technical Monograph No. 2, 6th Ed. May 2008, Croplife International」。

【0093】 本發明調配物較佳係呈以下一種型式：EC、SC、FS、SE、OD、WG、WP、CS，更佳係EC、SC、OD、WG、CS。

【0094】 有關調配物型式實例及其製法之進一步詳細說明提供於下文中。若存在兩種或更多種本發明化合物時，所出示之本發明化合物量係指本發明化合物之總量。若存在兩種或更多種例如：濕化劑、結合劑之此等代表性組份時，此點比照適用於調配物之任何其他組份。

i) 水溶性濃縮劑(SL、LS)

取 10-60%重量比之至少一種本發明化合物及 5-15%重量比之界面活性劑(例如：環氧乙烷及/或氧化丙烯與醇類之聚縮合物)溶於一定量之水及/或水溶性溶劑(例如：醇類，如：丙二醇，或碳酸酯，如：仲丙基碳酸酯)，其用量應達成總量 100%重量比。濃縮劑在施用之前先於水中稀釋。

ii) 勻散性濃縮劑(DC)

取 5-25%重量比之至少一種本發明化合物及 1-10%重量比之界面活性劑及/或結合劑(例如：聚乙基吡咯啉酮)溶於一定量之有機溶劑(例如：環己酮)，其用量應達成總量 100%重量比。加水稀釋形成勻散液。

iii) 可乳化濃縮劑(EC)

取 15-70%重量比之至少一種本發明化合物及 5-10%重量比之界面活性劑(例如：十二烷基苯磺酸鈣與蓖麻油乙氧化物之混合物)溶於一定量之水不可溶性有機溶劑(例如：芳香烴或脂肪酸醯胺)及若需要時使用其他水溶性溶劑，其用量應達成總量 100%重量比。加水稀釋形成乳液。

iv) 乳液(EW、EO、ES)

取 5-40%重量比之至少一種本發明化合物及 1-10%重量比之界面活性劑(例如：十二烷基苯磺酸鈣與蓖麻油乙氧化物之混合物、或環氧乙烷及/或氧化丙烯與或不與醇類之聚縮合物)溶於 20-40%重量比之水不可溶性有機溶劑(例如：芳香烴)。利用乳化機器，添加此混合物至一定量之水中，其用量應達成總量 100%重量比。所得調配物為均質乳液。該乳液在施用之前可進一步加水稀釋。

v) 懸浮液及懸浮濃縮劑

v-1) 水性(SC、FS)

在合適之研磨設備(例如：攪拌球磨機)中，取 20-60%重量比之至少一種本發明化合物，添加 2-10%重量比之界面活性劑(例如：木質素磺酸鈉及聚氧乙烯脂肪醇醚)、0.1-2%重量比之增稠劑(例如：黃原膠)與水一起磨製，產生均勻活性物質懸浮液。添加一定量之水，其用量應達成總量 100%重量比。加水稀釋，形成活性物質之安定懸浮液。FS 型調配物則添加至高 40%重量比之結合劑(例如：聚乙炔醇)。

v-2) 油性(OD、OF)

在合適之研磨設備(例如：攪拌球磨機)中，取 20-60%重量比之至少一種本發明化合物，添加 2-10%重量比之界面活性劑(例如：木質素磺酸鈉及聚氧乙烯脂肪醇醚)、0.1-2%重量比之增稠劑(例如：改質黏土，特定言之 Bentone，或矽石)及有機載劑一起磨製，產生均勻活性物質油懸浮液。添加一定量之有機載劑，其用量應達成總量 100%重量比。加水稀釋，形成活性物質之安定勻散液。

vi) 水勻散性粒劑及水溶性粒劑(WG、SG)

取 1-90%重量比，較佳為 20-80%，最佳為 50-80%重量比之至少一種本發明化合物，添加界面活性劑(例如：木質素磺酸鈉及烷基萘基磺酸鈉)及可能適用之載劑材料一起細磨，利用典型之技術設備，例如：擠壓、噴霧乾燥、流化床造粒法，轉換成水勻散性或水溶性粒劑。界面活性劑及載劑材料之用量應達成總量 100%重量比。加水稀釋，形成活性物質之安定勻散液或溶液。

vii) 水勻散性粉劑及水溶性粉劑(WP、SP、WS)

取 50-80%重量比之至少一種本發明化合物，於定子轉子研磨機(rotor-stator mill)中，添加 1-20%重量比之界面活性劑(例如：木質素磺酸鈉、烷基萘基磺酸鈉)及

一定量之固體載劑(例如：矽膠)研磨，其用量應達成總量 100%重量比。加水稀釋，形成活性物質之安定勻散液或溶液。

viii)凝膠(GW、GF)

在攪拌球磨機中，取 5-25%重量比之至少一種本發明化合物，添加 3-10%重量比之界面活性劑(例如：木質素磺酸鈉)、1-5%重量比之結合劑(例如：羧甲基纖維素)及一定量之水一起磨製，其用量應達成總量 100%重量比。結果產生均勻活性物質懸浮液。加水稀釋，形成活性物質之安定懸浮液。

ix) 微乳液 (ME)

取 5-20%重量比之至少一種本發明化合物加至 5-30%重量比之有機溶劑摻合物(例如：脂肪酸二甲基醯胺及環己酮)、10-25%重量比之界面活性劑摻合物(例如：聚氧乙烯脂肪醇醚及芳基苯酚乙氧化物)、及一定量之水中，其用量應達成總量 100%重量比。此混合物攪拌 1 h，自然產生熱動力學上安定之微乳液。

x) 微膠囊(CS)

取包含 5-50%重量比之至少一種本發明化合物、0-40%重量比之水不可溶性有機溶劑(例如：芳香烴)、2-15%重量比之丙烯系單體(例如：甲基丙烯酸甲酯、甲基丙烯酸、及二-或三丙烯酸酯)之油相勻散在保護性膠體(例如：聚乙二醇)之水溶液中。利用自由基引發劑引發自由基聚合反應，結果形成聚(甲基)丙烯酸酯微膠囊。或者，取包含 5-50%重量比之至少一種本發明化合物、0-40%重量比之水不可溶性有機溶劑(例如：芳香烴)、及異氰酸酯單體(例如：二苯基甲撐-4,4'-二異氰酸酯)之油相勻散在保護性膠體(例如：聚乙二醇)之水溶液中，結果形成聚脲微膠囊。可視需要添加多元胺(例如：六亞甲基二胺)，結果亦可形成聚脲微膠囊。單體量佔總 CS 調配物之 1-10%重量比。

xi) 塵粉化粉劑(DP、DS)

取 1-10%重量比之至少一種本發明化合物細磨，及與一定量之固體載劑，例如：均勻細磨之高嶺土均勻混合，其用量應達成總量 100%重量比。

xii) 粒劑(GR、FG)

取 0.5-30%重量比之至少一種本發明化合物細磨，與一定量之固體載劑(例如：矽酸鹽)組合，其用量應達成總量 100%重量比。

xiii) 超低體積液體(UL)

取 1-50%重量比之至少一種本發明化合物溶於一定量之有機溶劑，例如：芳香烴，其用量應達成總量 100%重量比。

【0095】 調配物型式 i)至xiii)可視需要包含其他輔劑，如：0.1-1%重量比之防腐劑、0.1-1%重量比之消泡劑、0.1-1%重量比之染劑與/或色素、及5-10%重量比之防凍劑。

混合物

【0096】 式(I)化合物亦可與一種或多種合適之殺真菌劑、殺細菌劑、殺蜚蠊劑、殺軟體動物劑、殺線蟲劑、殺昆蟲劑、殺微生物劑、有利生物體、除草劑、肥料、驅鳥劑、強化植物劑、不孕劑、安全劑、化學傳訊物質及/或植物生長調節劑形成混合物使用，藉以例如：擴大作用範圍、延長作用效期、提高作用速率、防止排斥或預防發展出抗性。此外，這種活性化合物組合可以改善植物生長及/或對非生物性因子之耐受性，例如：對高溫或低溫、對乾旱或對上升之水份或土壤鹽份含量之耐受性。亦可改善開花與結果性能、優化發芽能力與根部發展、促進收成及改善產量、影響成熟、改善所收成產物之品質與/或營養價值、為所收成產物延長儲存壽命及/或改善可加工性。

【0097】 此外，式(I)化合物可與其他活性化合物或化學傳訊物質(如：引誘劑與/或驅鳥劑與/或植物活化劑與/或生長調劑與/或肥料)形成混合物。同樣地，式(I)化合物可用於改善植物性質(例如：生長、產量、及所收成材料之品質)。

【0098】 根據本發明特定實施例中，式(I)化合物係與其他化合物(較佳係與下文說明者)形成混合物，而呈調配物型式或由該調配物製成之施用型式。

【0099】 若下文述及之其中一種化合物可出現不同互變異構型，即使沒有個別出示，此等型式亦均包括在內。此外，所有指名之混合組份亦可能依據其官能基，可能視需要與合適鹼類或酸類形成鹽類。

殺昆蟲劑/殺蟬蟎劑/殺線蟲劑

【0100】 本文中以其俗名稱呼之活性化合物為已知者且說明於例如：殺蟲劑手冊(「The Pesticide Manual」，第16版，British Crop Protection Council 2012)或可搜尋網際網路(例如：<http://www.alanwood.net/pesticides>)。該分類法係依據本專利申請案提出申請當時所適用之「IRAC作用模式分類圖(IRAC Mode of Action Classification Scheme)」。

(1) 乙醯基膽鹼酯酶(AChE)抑制劑，較佳為胺甲酸酯類，其係選自：棉鈴威(alanycarb)、得滅克(aldicarb)、免敵克(bendiocarb)、免扶克(benfuracarb)、佈嘉信(butocarboxim)、丁酮碘威(butoxycarboxim)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、丁基加保扶(carbosulfan)、乙硫苯威(ethiofencarb)、丁基滅必蝨(fenobucarb)、覆滅蟎(formetanate)、呋線威(furathiocarb)、滅必蝨(isoprocab)、滅賜克(methiocarb)、納乃得(methomyl)、治滅蝨(metolcarb)、歐殺滅(oxamyl)、比加普(pirimicarb)、安丹(propoxur)、硫敵克(thiodicarb)、硫伐隆(thiofanox)、啞呋威(triazamate)、三甲威(trimethacarb)、XMC 與滅爾蝨(xylcarb)；或有機磷酸酯類，其係選自：歐殺松(acephate)、甲基吡啶磷(azamethiphos)、乙基穀速松(azinphos-ethyl)、甲基穀速松(azinphos-methyl)、卡速松(cadusafos)、氯乙松

(chlorethoxyfos)、氯芬松(chlorfenvinphos)、氯滅松(chlormephos)、甲基陶斯松(chlorpyrifos-methyl)、庫伏斯(coumaphos)、氰乃松(cyanophos)、S-甲基滅賜松(demeton-S-methyl)、大利松(diazinon)、二氯松(dichlorvos)/DDVP、雙特松(dicrotophos)、大滅松(dimethoate)、大芬松(dimethylvinphos)、二硫松(disulfoton)、EPN、愛殺松(ethion)、普伏松(ethoprophos)、胺磺磷(famphur)、芬滅松(fenamiphos)、撲滅松(fenitrothion)、芬殺松(fenthion)、福賽特(fosthiazate)、飛達松(heptenophos)、抑滅伏(imicyafos)、抑伏松(isofenphos)、O-(甲氧基胺基硫代磷鹽基)水楊酸異丙基酯、抑殺松(isoxathion)、馬拉松(malathion)、滅加松(mecarbam)、達馬松(methamidophos)、滅大松(methidathion)、美文松(mevinphos)、亞素靈(monocrotophos)、乃立松(naled)、歐滅松(omethoate)、甲基歐滅賜松(oxydemeton-methyl)、甲基巴拉松(parathion-methyl)、賽達松(phenthoate)、福瑞松(phorate)、裕必松(phosalone)、益滅松(phosmet)、福賜米松(phosphamidon)、辛硫磷(phoxim)、甲基亞特松(pirimiphos-methyl)、佈飛松(profenofos)、普丹松(propetamphos)、普硫松(prothiofos)、必伏松(pyraclufos)、必芬松(pyridaphenthion)、拜裕松(quinalphos)、速伏特(sulfotep)、特必松(tebupirimfos)、亞培松(temephos)、託福松(terbufos)、四氯松(tetrachlorvinphos)、硫滅松(thiometon)、三落松(triazophos)、三氯松(triclorfon)與繁米松(vamidothion)。

(2) GABA-閘控之氯離子通道阻斷劑，較佳為環二烯-有機氯，其係選自：克丹(chlordane)與安殺番(endosulfan)；或苯基吡唑類(飛普洛類(Fiprole))，其係選自：抑普洛(ethiprole)與芬普尼(fipronil)。

(3) 鈉通道調控劑，較佳為擬除蟲菊酯類，其係選自：阿納寧(acrinathrin)、丙烯菊酯(allethrin)、d-順式-反式丙烯菊酯、d-反式丙烯菊酯、畢芬寧(bifenthrin)、右亞列寧(bioallethrin)、右亞列寧 S-環戊烯基異構物、必賽靈(bioresmethrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、β-賽扶寧、賽洛寧(cyhalothrin)、λ-賽洛

寧、 γ -賽洛寧、賽滅寧(cypermethrin)、 α -賽滅寧、 β -賽滅寧、 θ -賽滅寧、 ζ -賽滅寧、賽芬寧(cyphenothrin)[(1R)-反式異構物]、第滅寧(deltamethrin)、依普靈(empenthrin)[(EZ)-(1R)異構物]、益化利(esfenvalerate)、依芬寧(etofenprox)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、護賽寧(flucythrinate)、氟氯苯氰菊酯(flumethrin)、 τ -福化利(flualinate)、合芬寧(halfenprox)、益普靈(imiprothrin)、剋特寧(kadethrin)、甲氧苄氟菊酯(momfluorothrin)、百滅寧(permethrin)、酚丁滅寧(phenothrin)[(1R)-反式異構物]、普亞列寧(prallethrin)、除蟲菊酯(pyrethrins(pyrethrum))、列滅靈(resmethrin)、矽護芬(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin)、治滅靈(tetramethrin)、治滅靈[(1R)異構物]、泰滅寧(tralomethrin)與拜富寧(transfluthrin)；或 DDT 或甲氧基氯(methoxychlor)。

(4) 菸鹼激導性乙醯基膽鹼受體(nAChR)競爭性調控劑，較佳為類新菸鹼類，其係選自：亞滅培(acetamiprid)、可尼丁(clothianidin)、達特南(dinotefuran)、益達胺(imidacloprid)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、賽果培(thiacloprid)與賽速安(thiamethoxam)；或尼古丁，或亞砒亞胺類，其係選自：砒蟲啉(sulfoxaflor)，或丁烯內酯類，其係選自：伏達隆(flupyradifurone)，或中離子化合物類(mesoionics)，其係選自：三氟滅靈(Triflumezopyrim)。

(5) 菸鹼激導性乙醯基膽鹼受體(nAChR)異位性調控劑(位點 I)，較佳為賜諾殺類(Spinosyns)，其係選自：賜諾特(spinetoram)與賜諾殺(spinosad)。

(6) 麩胺酸閘控氯離子通道(GluCl)異位性調控劑，較佳為阿維菌素類(ivermectins)/米爾倍黴素(milbemycin)，其係選自：阿巴汀(abamectin)、因滅汀(emamectin)苯甲酸酯、利派菌素(lepimectin)與密滅汀(milbemectin)。

(7) 幼保激素擬似物，較佳為幼保激素類似物，其係選自：烯蟲乙酯(hydroprene)、烯蟲炔酯(kinoprene)與美賜平(methoprene)；或芬諾克(fenoxycarb)或百利普芬(pyriproxyfen)。

(8) 其他非專一性(多重位點)抑制劑，較佳為烷基鹵化物，其係選自：甲基溴及其他烷基鹵化物；或氯吡靈(chloropicrin)；或硫醯氟；或硼砂；或酒石酸銻鉀鹽；或異氰酸甲酯發生劑，其係選自：棉隆(diazomet)與威百畝(metam)。

(9) 弦音感覺器官 TRPV 通道調控劑，較佳為吡啶偶氮甲烷類，其係選自：派滅淨(pymetrozine)與氟啶蟲胺腈(pyrifluquinazone)，或丙烯類(pyropenes)，其係選自：雙丙環蟲酯(afidopyropen)。

(10) 影響 CHS1 之蟎生長抑制劑，其係選自：克芬蟎(clofentezine)、合賽多(hexythiazox)、氟蟎嗪(diflovidazin)、及依殺蟎(etoxazole)。

(11) 昆蟲腸膜之微生物瓦解劑，其係選自：蘇雲金芽胞桿菌以色列亞種(*Bacillus thuringiensis* subspecies *israelensis*)、球形芽孢桿菌(*Bacillus sphaericus*)、蘇雲金芽胞桿菌鮎澤亞種(*Bacillus thuringiensis* subspecies *aizawai*)、蘇雲金芽胞桿菌庫斯塔基亞種(*Bacillus thuringiensis* subspecies *kurstaki*)、蘇雲金芽胞桿菌殺蟲亞種(*Bacillus thuringiensis* subspecies *tenebrionis*)，及 *B.t* 植物蛋白質，其係選自：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb 與 Cry34Ab1/35Ab1。

(12) 粒線體 ATP 合成酶抑制劑，較佳為 ATP 瓦解劑，其係選自：汰芬隆(diafenthiuron)；或有機錫化合物，其係選自：亞環錫(azocyclotin)、錫蟎丹

(cyhexatin)與芬佈賜(fenbutatin oxide)；或歐蟊多(propargite)或三氯殺蟊虱(tetradifon)。

(13) 破壞質子梯度之氧化性磷酸化反應去偶合劑，其係選自：克凡派(chlorfenapyr)、DNOC與氟蟲胺(sulfluramid)。

(14) 菸鹼激導性乙醯基膽鹼受體通道阻斷劑，其係選自：免速達(bensultap)、培丹(cartap)鹽酸鹽、硫賜安(thiocylam)與殺蟲雙(Thiosultap-sodium)。

(15) 影響 CHS1 之幾丁質生物合成抑制劑，較佳為苯甲醯脲類，其係選自：雙三氟蟲脲(bistrifluron)、克福隆(chlofluazuron)、二福隆(diflubenzuron)、氟環脲(flucycloxuron)、氟芬隆(flufenoxuron)、六伏隆(hexaflumuron)、祿芬隆(lufenuron)、諾伐隆(novaluron)、諾福隆(noviflumuron)、得福隆(teflubenzuron)與三福隆(triflumuron)。

(16) 幾丁質生物合成抑制劑，第 1 型，其係選自：布芬淨(buprofezin)。

(17) 蛻變瓦解劑(特定言之雙翅目，亦即雙翅目昆蟲)，其係選自：賽滅淨(cyromazine)。

(18) 脫皮激素受體促效劑，較佳為二醯基肼類，其係選自：可芬諾(chromafenozide)、赫芬賽(halofenozide)、甲氧芬賽(methoxyfenozide)與特芬賽(tebufenozide)。

(19) 章魚胺受體促效劑，其係選自：三亞蟊(amitraz)。

(20) 粒線體複合物-III 電子轉運抑制劑，其係選自：海滅能(hydramethylnone)、亞克希(acequinocyl)、伏克靈(flucrypyrim)、及必芬蟎(bifenazate)。

(21) 粒線體複合物-I 電子轉運抑制劑，較佳為：METI 殺蟎劑及殺昆蟲劑，其係選自：芬殺蟎(fenazaquin)、芬普蟎(fenpyroximate)、普靈芬(pyrimidifen)、畢達本(pyridaben)、達芬必(tebufenpyrad)與特芬必(tolfenpyrad)；或魚藤精(rotenone)(Derris)。

(22) 依賴電壓之鈉通道阻斷劑，較佳為喹二嗪類，其係選自：因得克(indoxacarb)，或縮胺基脲類，其係選自：滅伏美松(metaflumizone)。

(23) 乙醯基-CoA 羧酸酶之抑制劑，較佳為：季酮酸與吡咯酮酸衍生物，其係選自：螺克芬(spirodiclofen)、螺滅芬(spiromesifen)、螺蟲定酮(spiropidion)與賜派滅(spirotetramat)。

(24) 粒線體複合物 IV 電子轉運抑制劑，較佳為：磷化物，其係選自：磷化鋁、磷化鈣、磷與磷化鋅；或氰化物，其係選自：氰化鈣、氰化鉀、與氰化鈉。

(25) 粒線體複合物 II 電子轉運抑制劑，較佳為： β -酮基脒衍生物，其係選自：氰必吩(cyenopyrafen)與賽芬蟎(cyflumetofen)，或羧基替苯胺類，其係選自：必伏拜(pyflubumide)。

(28) 蘭尼鹼(ryanodine)受體調控劑，較佳為：二醯胺類，其係選自：氯蒽吡咯(chlorantraniliprole)、氰蟲醯胺(cyantraniliprole)、環溴蟲醯胺(cyclaniliprole)、表氟蟲胺(flubendiamide)、及氟氰蟲醯胺(tetraniliprole)。

(29) 弦音感覺器官調控劑(無特定標靶位點)，其係選自：伏卡滅(flonicamid)。

(30) GABA-閘控氯離子通道異位性調控劑，較佳為間位二醯胺類，其係選自：布伏利(broflanilide)，或異喹啉類，其係選自：氟賽醯胺(Fluxametamide)。

(31) 桿狀病毒，較佳為顆粒體病毒(GV)，其係選自：蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella*) GV 與假蘋果蠹蛾(*Thaumatotibia leucotreta*)(GV)、或核多角病毒(Nucleopolyhedroviruses) (NPV)，其係選自：大豆夜蛾(*Anticarsia gemmatilis*)MNPV 及番茄夜蛾(*Helicoverpa armigera*) NPV。

(32) 菸鹼激導性乙醯基膽鹼受體異位性調控劑(位點 II)，其係選自：GS- ω /k-HXTX-Hv1a 肽。

(33) 其他活性化合物，係選自：艾辛納比(Acynonapyr)、艾伏樂(Afoxolaner)、查得定(Azadirachtin)、苯克賽(Benclothiaz)、苯賽滅(Benzoximate)、苯吡莫賽(Benzpyrimoxan)、新殺蟎(Bromopropylate)、蟎離丹(Chinomethionat)、氯丙炔菊酯(Chloroprallethrin)、克利得(Cryolite)、環丁伏樂(Cyclobutirfluram)、環氧蟲啉(Cycloxaprid)、腈吡蟎酯(Cyetyprafen)、氯氟氰蟲醯胺(Cyhalodiamide)、賽普氟醯胺(Cyproflanilide)(CAS 2375110-88-4)、二氯滅嗪(Dicloromezotiaz)、大克蟎(Dicofol)、大普達嗪(Dimpropyridaz)、 ϵ -美特寧(epsilon-Metofluthrin)、 ϵ -滅伏靈(epsilon-Momfluthrin)、氟啞啉(Flometoquin)、氟吡啉辛(Fluazaindolizine)、氟氰戊菊酯(Flucyprirprole)(CAS 1771741-86-6)、氟速吩(Fluensulfone)、伏吩靈(Flufenerim)、氟菌蟎酯(Flufenoxystrobin)、丁烯氟蟲腈(Flufiprole)、氟赫吩(Fluhexafon)、氟吡菌醯胺(Fluopyram)、氟必靈(Flupyrimin)、氟樂(Fluralaner)、呋喃蟲醯肼(Fufenozide)、氟戊芬諾斯(Flupentiofenox)、戊吡蟲肼(Guadipyr)、氯氟醚菊酯(Heptafluthrin)、氯噁啉(Imidaclothiz)、依普同(Iprodione)、抑克斯能

(Isocycloseram)、κ-畢芬寧(kappa-Bifenthrin)、κ-特芬寧(kappa-Tefluthrin)、樂地蘭 (Lotilaner)、氯氟醚菊酯 (Meperfluthrin)、尼克普 (Nicofluprole)(CAS 1771741-86-6)、歐賽菲 (Oxazosulflor)、吡蟲啉 (Paichongding)、吡啶蟲丙醚 (Pyridalyl)、必伏松 (Pyriproxyfen)、嘧蟲啉 (Pyriminostrobin)、賽蘭 (Sarolaner)、速必滅特 (Spidoxamat)、賜派芬 (Spirobutolifen)、四氯醚菊酯 (Tetramethylfluthrin)、四氯剋安勃 (Tetrachlorantraniliprole)、塔格納 (Tigolaner)、塔賽吩 (Tioxazafen)、硫氟賜滅 (Thiofluoximate)、泰克啞伏 (Tyclopyrazoflor)、碘甲烷；及其他基於堅強芽孢桿菌 (*Bacillus firmus*) 之製劑 (I-1582, Votivo) 及印楝素 (azadirachtin)(BioNeem)，及下列化合物：1-{2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亞磺基]苯基}-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺 (來自 WO2006/043635) (CAS 885026-50-6)、2-氯-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]吡啶-4-基}-4-(三氟甲基)苯基]異菸鹼醯胺 (來自 WO2006/003494) (CAS 872999-66-1)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-4-羥基-8-甲氧基-1,8-二氮雜螺[4.5]癸-3-烯-2-酮 (來自 WO 2010052161) (CAS 1225292-17-0)、乙基碳酸 3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-側氧基-1,8-二氮雜螺[4.5]癸-3-烯-4-基酯(3-(4-chloro-2,6-dimethylphenyl)-8-methoxy-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl ethyl carbonate, 來自 EP2647626) (CAS 1440516-42-6)、PF1364 (來自 JP2010/018586) (CAS 1204776-60-2)、(3E)-3-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-亞吡啶基]-1,1,1-三氟-丙烷-2-酮 (來自 WO2013/144213) (CAS 1461743-15-6)、N-[3-(苯甲基胺甲醯基)-4-氯苯基]-1-甲基-3-(五氟乙基)-4-(三氟甲基)-1H-吡啶-5-甲醯胺 (來自 WO2010/051926) (CAS 1226889-14-0)、5-溴-4-氯-N-[4-氯-2-甲基-6-(甲基胺甲醯基)苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)吡啶-3-甲醯胺 (來自 CN103232431) (CAS 1449220-44-3)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-2-甲基-N-(順式-1-氧離子基-3-硫雜環丁烷基)-苯甲醯胺、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-2-甲基-N-(反式-1-氧離子基-3-硫雜環丁烷基)-苯甲醯胺及 4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-2-甲基-N-(順式-1-氧離子基-3-硫雜環丁烷基)苯甲

醯胺(來自 WO 2013/050317 A1) (CAS 1332628-83-7)、*N*-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1*H*-吡唑-4-基]-*N*-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亞磺醯基]-丙醯胺、(+)-*N*-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1*H*-吡唑-4-基]-*N*-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亞磺醯基]-丙醯胺及(-)-*N*-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1*H*-吡唑-4-基]-*N*-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亞磺醯基]-丙醯胺(來自 WO 2013/162715 A2 、 WO 2013/162716 A2 、 US 2014/0213448 A1) (CAS 1477923-37-7)、5-[[*(2E)*-3-氯-2-丙烯-1-基]胺基]-1-[2,6-二氯-4-(三氟甲基)苯基]-4-[(三氟甲基)亞磺醯基]-1*H*-吡唑-3-甲腈(來自 CN 101337937 A) (CAS 1105672-77-2)、3-溴-*N*-[4-氯-2-甲基-6-[(甲基胺基)硫代甲基]苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-甲醯胺(Liudaibenjiaxuanan, 來自 CN 103109816 A) (CAS 1232543-85-9)、*N*-[4-氯-2-[(1,1-二甲基乙基)胺基]羰基]-6-甲基苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(氟甲氧基)-1*H*-吡唑-5-甲醯胺(來自 WO 2012/034403 A1) (CAS 1268277-22-0)、*N*-[2-(5-胺基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-甲醯胺(來自 WO 2011/085575 A1) (CAS 1233882-22-8)、4-[3-[2,6-二氯-4-[(3,3-二氯-2-丙烯-1-基)氧]苯氧基]丙氧基]-2-甲氧基-6-(三氟甲基)-嘧啶(來自 CN 101337940 A) (CAS 1108184-52-6)、*(2E)*-及 *2(Z)*-2-[2-(4-氰基苯基)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亞乙基]-*N*-[4-(二氟甲氧基)苯基]-肼甲醯胺(來自 CN 101715774 A) (CAS 1232543-85-9)、3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基-4-(1*H*-苯并咪唑-2-基)苯基-環丙烷羧酸酯(來自 CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4)、(4*aS*)-7-氯-2,5-二氫-2-[(甲氧基羰基)[4-[(三氟甲基)硫]苯基]胺基]羰基]-茚并[1,2-*e*][1,3,4]噁二嗪-4*a*(3*H*)-羧酸甲基酯(來自 CN 102391261 A) (CAS 1370358-69-2)、6-去氧-3-*O*-乙基-2,4-二-*O*-甲基-, 1-[*N*-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-五氟乙氧基)苯基]-1*H*-1,2,4-三唑-3-基]苯基]胺甲酸酯]- α -L-哌喃甘露糖(來自 US 2014/0275503 A1) (CAS 1181213-14-8)、8-(2-環丙基甲氧基-4-三氟甲基-苯氧基)-3-(6-三氟甲基-嗒嗪-3-基)-3-氮雜-雙環[3.2.1]辛烷(CAS 1253850-56-4)、(8-反側)-8-(2-環丙基甲氧基-4-三氟甲基-苯氧基)-3-(6-三氟甲基-嗒嗪-3-基)-3-氮雜-雙環[3.2.1]辛烷(CAS 933798-27-7)、(8-同側)-8-(2-環丙基甲氧基-4-三氟甲基-苯氧基)-3-(6-三氟甲基-嗒

噻-3-基)-3-氮雜-雙環[3.2.1]辛烷(來自 WO 2007040280 A1、WO 2007040282 A1) (CAS 934001-66-8)、N-[4-(胺基硫代甲基)-2-甲基-6-[(甲基胺基)羰基]苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-甲醯胺(來自 CN 103265527 A) (CAS 1452877-50-7)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-1-甲基-1,8-二氮雜螺[4.5]癸烷-2,4-二酮(來自 WO 2014/187846 A1) (CAS 1638765-58-8)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-1-甲基-2-側氧基-1,8-二氮雜螺[4.5]癸-3-烯-4-基-碳酸乙基酯(來自 WO 2010/066780 A1、WO 2011151146 A1) (CAS 1229023-00-0)、N-[1-(2,6-二氟苯基)-1*H*-吡唑-3-基]-2-(三氟甲基)苯甲醯胺(來自 WO 2014/053450 A1) (CAS 1594624-87-9)、N-[2-(2,6-二氟苯基)-2*H*-1,2,3-三唑-4-基]-2-(三氟甲基)苯甲醯胺(來自 WO 2014/053450 A1) (CAS 1594637-65-6)、N-[1-(3,5-二氟-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-3-基]-2-(三氟甲基)苯甲醯胺(來自 WO 2014/053450 A1) (CAS 1594626-19-3)、(3*R*)-3-(2-氯-5-噻唑基)-2,3-二氫-8-甲基-5,7-二側氧基-6-苯基-5*H*-噻唑并[3,2-*a*]嘧啶鎬內鹽(來自 WO 2018/177970 A1) (CAS 2246757-58-2)、3-(2-氯-5-噻唑基)-2,3-二氫-8-甲基-5,7-二側氧基-6-苯基-5*H*-噻唑并[3,2-*a*]嘧啶鎬內鹽(來自 WO 2018/177970 A1) (CAS 2246757-56-0)、N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1*H*-吡唑-4-基]-2-(甲基磺醯基)-丙醯胺(來自 WO 2019/236274 A1) (CAS 2396747-83-2)、N-[2-溴-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]-6-(三氟甲基)苯基]-2-氟-3-[(4-氟苯甲醯基)胺基]-苯甲醯胺(來自 WO 2019059412 A1) (CAS 1207977-87-4)。

殺真菌劑

【0101】 本文中以其俗名稱呼之活性成份為已知者且說明於例如：「The Pesticide Manual」(第16版，British Crop Protection Council)或可搜尋網際網路(例如：www.alanwood.net/pesticides)。

【0102】 (1)至(15)類所列之所有殺真菌劑混合對象若可能時，可依其官能基視需要與合適之鹼類或酸類形成鹽類。(1)至(15)類所列之所有混合對象若可能時，亦可包括互變異構型。

1) 麥角固醇生物合成抑制劑，例如：(1.001)環克座(cyproconazole)，(1.002)待克利(difenoconazole)，(1.003)環氧克唑(epoxiconazole)，(1.004)苯六胺(fenhexamide)，(1.005)苯銹啉(fenpropidin)，(1.006)芬普福(fenpropimorph)，(1.007)胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)，(1.008)氟喹唑(fluquinconazole)，(1.009)護汰芬(flutriafol)，(1.010)依滅列(imazalil)，(1.011)依滅列硫酸鹽(imazalil sulphate)，(1.012)種菌唑(ipconazole)，(1.013)滅特唑(metconazole)，(1.014)邁克尼(myclobutanil)，(1.015)巴克素(paclobutrazole)，(1.016)撲克樂(prochloraz)，(1.017)普克利(propiconazole)，(1.018)丙硫菌唑(prothioconazole)，(1.019)吡啉菌唑(pyrisoxazole)，(1.020)螺環菌胺(spiroxamine)，(1.021)得克利(tebuconazole)，(1.022)四克利(tetraconazole)，(1.023)三泰隆(triadimenol)，(1.024)三得芬(tridemorph)，(1.025)滅菌唑(triticonazole)，(1.026)(1R,2S,5S)-5-(4-氯苯甲基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)環戊醇，(1.027)(1S,2R,5R)-5-(4-氯苯甲基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)環戊醇，(1.028)(2R)-2-(1-氯環丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯環丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇，(1.029)(2R)-2-(1-氯環丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯環丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇，(1.030)(2R)-2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇，(1.031)(2S)-2-(1-氯環丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯環丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇，(1.032)(2S)-2-(1-氯環丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯環丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇，(1.033)(2S)-2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇，(1.034)(R)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇，(1.035)(S)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇，(1.036)[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇，(1.037)1-({(2R,4S)-2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-4-甲基-1,3-二氧雜環戊烷-2-基}甲基)-1H-1,2,4-三唑，(1.038)1-({(2S,4S)-2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-4-甲基-1,3-二氧雜環戊烷-2-基}甲基)-1H-1,2,4-三唑，(1.039)硫氰酸 1-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-

二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基酯，(1.040)硫氰酸 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基酯，(1.041)硫氰酸 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基酯，(1.042)2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(1.043)2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(1.044)2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(1.045)2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(1.046)2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(1.047)2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(1.048)2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(1.049)2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(1.050)2-[1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(1.051)2-[2-氯-4-(2,4-二氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇，(1.052)2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇，(1.053)2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇，(1.054)2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)戊-2-醇，(1.055)氯氟醚菌唑(Mefentrifluconazole)，(1.056)2-[[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(1.057)2-[[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(1.058)2-[[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(1.059)5-(4-氯苯基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)環戊醇，(1.060)5-(烯丙基氫硫基)-1-[[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲

基}-1H-1,2,4-三唑，(1.061)5-(烯丙基氫硫基)-1-[[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基]-1H-1,2,4-三唑，(1.062)5-(烯丙基氫硫基)-1-[[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基]-1H-1,2,4-三唑，(1.063)N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]氫硫基}苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒，(1.064)N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(2,2,2-三氟乙氧基)苯基]氫硫基}苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒，(1.065)N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(2,2,3,3-四氟丙氧基)苯基]氫硫基}苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒，(1.066)N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(五氟乙氧基)苯基]氫硫基}苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒，(1.067)N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(1,1,2,2-四氟乙基)氫硫基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒，(1.068)N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(2,2,2-三氟乙基)氫硫基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒，(1.069)N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(2,2,3,3-四氟丙基)氫硫基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒，(1.070)N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(五氟乙基)氫硫基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒，(1.071)N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒，(1.072)N'-(4-{[3-(二氟甲氧基)苯基]氫硫基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒，(1.073)N'-(4-{3-[(二氟甲基)氫硫基]苯氧基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒，(1.074)N'-[5-溴-6-(2,3-二氫-1H-茚-2-基氧)-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基甲脒，(1.075)N'-[4-[(4,5-二氯-1,3-噻唑-2-基)氧]-2,5-二甲基苯基]-N-乙基-N-甲基甲脒，(1.076)N'-[5-溴-6-[(1R)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基甲脒，(1.077)N'-[5-溴-6-[(1S)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基甲脒，(1.078)N'-[5-溴-6-[(順式-4-異丙基環己基)氧]-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基甲脒，(1.079)N'-[5-溴-6-[(反式-4-異丙基環己基)氧]-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基甲脒，(1.080)N'-[5-溴-6-[1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基甲脒，(1.081)抑氟康唑(ipfentrifluconazole)，(1.082)2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇，(1.083)2-[6-(4-溴苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇，(1.084)2-[6-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇，

(1.085)3-[2-(1-氯環丙基)-3-(3-氯-2-氟-苯基)-2-羥基-丙基]咪唑-4-甲腈，及
(1.086)4-[[6-[rac-(2R)-2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羥基-3-(5-硫代-4H-1,2,4-三唑
-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧]苯甲腈。

2) 複合物 I 或 II 之呼吸鏈抑制劑，例如：(2.001)苯并烯氟菌唑(benzovindiflupyr)，
(2.002)聯苯吡菌胺(bixafen)，(2.003)白克列(boscalid)，(2.004)萎銹靈(carboxin)，
(2.005)氟派瑞(fluopyram)，(2.006)福多寧(flutolanil)，(2.007)氟克殺(fluxapyroxad)，
(2.008)福拉比(furametpyr)，(2.009)異丙噻菌胺(isofetamid)，(2.010)亞派占
(isopyrazam)(反側-差向對映異構物 1R,4S,9S)，(2.011)亞派占(反側-差向對映異構
物 1S,4R,9R)，(2.012)亞派占(反側-差向異構消旋物 1RS,4SR,9SR)，(2.013)亞派
占(同側-差向異構消旋物 1RS,4SR,9RS 與反側-差向異構消旋物 1RS,4SR,9SR 之
混合物)，(2.014)亞派占(同側-差向對映異構物 1R,4S,9R)，(2.015)亞派占(同側-
差向對映異構物 1S,4R,9S)，(2.016)亞派占(同側-差向異構消旋物 1RS,4SR,9RS)，
(2.017)平氟芬(penflufen)，(2.018)平硫瑞(penthiopyrad)，(2.019)氟唑菌醯胺
(pydiflumetofen)，(2.020)必福滅(pyraziflumid)，(2.021)氟唑環菌胺(sedaxane)，
(2.022)1,3-二甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲醯胺，
(2.023)1,3-二甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲醯胺，
(2.024)1,3-二甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲醯胺，
(2.025)1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[2'-(三氟甲基)聯苯-2-基]-1H-吡唑-4-甲醯胺，
(2.026)2-氟-6-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)苯甲醯胺，
(2.027)3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲
醯胺，(2.028)氟蟲胺(inpyrfluxam)，(2.029)3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3S)-1,1,3-三
甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲醯胺，(2.030)氟茛唑菌胺(fluidapyr)，
(2.031)3-(二氟甲基)-N-[(3R)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-
吡唑-4-甲醯胺，(2.032)3-(二氟甲基)-N-[(3S)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-
基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(2.033)5,8-二氟-N-[2-(2-氟-4-{[4-(三氟甲基)吡啶

-2-基]氧} 苯基) 乙基] 喹啉-4-胺，(2.034)N-(2-環戊基-5-氟苯基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.035)N-(2-第三丁基-5-甲基苯基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.036)N-(2-第三丁基-5-甲基苯基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.037)N-(5-氯-2-乙基苯基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.038)N-(5-氯-2-異丙基苯基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.039)N-[(1R,4S)-9-(二氯亞甲基)-1,2,3,4-四氫-1,4-甲撐基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.040)N-[(1S,4R)-9-(二氯亞甲基)-1,2,3,4-四氫-1,4-甲撐基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.041)N-[1-(2,4-二氯苯基)-1-甲氧基丙-2-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.042)N-[2-氯-6-(三氟甲基)苯基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.043)N-[3-氯-2-氟-6-(三氟甲基)苯基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.044)N-[5-氯-2-(三氟甲基)苯基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.045)N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-N-[5-甲基-2-(三氟甲基)苯基]-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.046)N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-氟-6-異丙基苯基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.047)N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-異丙基-5-甲基苯基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.048)N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-異丙基苯基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲硫醯胺，(2.049)N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-異丙基苯基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.050)N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(5-氟-2-異丙基苯基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.051)N-環丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-4,5-二甲基苯基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.052)N-環丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-氟苯基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.053)N-環丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-甲基苯基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.054)N-環丙基-N-(2-環丙基-5-氟苯基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺，(2.055)N-環丙基-N-(2-環丙基-5-甲基苯基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶

-4-甲醯胺，(2.056)N-環丙基-N-(2-環丙基苯甲基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(2.057)吡丙能(pyrapropoyne)。

3) 複合物 III 之呼吸鏈抑制劑，例如：(3.001)辛唑啉菌胺(ametoctradin)，(3.002)安美速(amisulbrom)，(3.003)亞托敏(azoxystrobin)，(3.004)甲香菌酯(coumethoxystrobin)，(3.005)丁香菌酯(coumoxystrobin)，(3.006)賽座滅(cyazofamid)，(3.007)醚菌胺(dimoxystrobin)，(3.008)烯肟菌酯(enoxastrobin)，(3.009)凡殺同(famoxadone)，(3.010)咪唑菌酮(fenamidone)，(3.011)吩啉菌酯(flufenoxystrobin)，(3.012)氟啉菌酯(fluoxastrobin)，(3.013)甲基醚菌酯(kresoxim-methyl)，(3.014)氧菌胺(metominostrobin)，(3.015)肟醚菌胺(orysastrobin)，(3.016)啉氧菌酯(picoxystrobin)，(3.017)啉菌胺酯(pyraclostrobin)，(3.018)啉胺菌酯(pyrametostrobin)，(3.019)啉菌酯(pyraoxystrobin)，(3.020)三氟敏(trifloxystrobin)，(3.021)(2E)-2-{2-[[[(1E)-1-(3-[(E)-1-氟-2-苯基乙烯基]氧)苯基]亞乙基]胺基]氧)甲基]苯基}-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基乙醯胺，(3.022)(2E,3Z)-5-{[1-(4-氯苯基)-1H-吡唑-3-基]氧}-2-(甲氧基亞胺基)-N,3-二甲基戊-3-烯醯胺，(3.023)(2R)-2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙醯胺，(3.024)(2S)-2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙醯胺，(3.025)吩克醯胺(fenpicoxamid)，(3.026)曼特斯本(mandestrobin)，(3.027)N-(3-乙基-3,5,5-三甲基環己基)-3-甲醯胺基-2-羥基苯甲醯胺，(3.028)(2E,3Z)-5-{[1-(4-氯-2-氟苯基)-1H-吡唑-3-基]氧}-2-(甲氧基亞胺基)-N,3-二甲基戊-3-烯醯胺，(3.029){5-[3-(2,4-二甲基苯基)-1H-吡唑-1-基]-2-甲基苯甲基}胺甲酸甲酯，(3.030)甲特普啉(metyltetraprole)，(3.031)氟比醯胺(florylpicoxamid)。

4) 有絲分裂與細胞分化抑制劑，例如：(4.001)貝芬替(carbendazim)，(4.002)乙霉威(diethofencarb)，(4.003)噻唑菌胺(ethaboxam)，(4.004)氟吡菌胺(fluopicolid)，(4.005)賓克隆(pencycuron)，(4.006)腐絕(thiabendazole)，(4.007)甲基多保淨

(thiophanate-methyl)，(4.008)座賽胺(zoxamide)，(4.009) 3-氯-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基-5-苯基噁嗪，(4.010)3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基噁嗪，(4.011)3-氯-5-(6-氯吡啶-3-基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)噁嗪，(4.012)4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺，(4.013)4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺，(4.014)4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺，(4.015)4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺，(4.016)4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺，(4.017)4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺，(4.018)4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺，(4.019)4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺，(4.020)4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺，(4.021)4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺，(4.022)4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基噁嗪，(4.023)N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺，(4.024)N-(2-溴苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺，(4.025)N-(4-氯-2,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺。

5) 可以具有多重位點作用之化合物，例如：(5.001)波爾多(Bordeaux)混合物，(5.002)四氯丹(captafol)，(5.003)蓋普丹(captan)，(5.004)四氯異苯腈(chlorthalonil)，(5.005)氫氧化銅，(5.006)蔡甲酸銅，(5.007)氧化銅，(5.008)鹼性氫氧化銅，(5.009)硫酸銅(2+)，(5.010)腈硫醌(dithianon)，(5.011)多寧(dodin)，(5.012)福爾培(folpet)，(5.013)錳粉克(mancozeb)，(5.014)錳乃浦(maneb)，(5.015)免得爛(metiram)，(5.016)免得爛鋅鹽，(5.017)快得寧(oxine-copper)，(5.018)甲基鋅乃浦(propineb)，(5.019)硫與硫製劑，包括：多硫化鈣，(5.020)得恩地(thiram)，(5.021)鋅乃浦(zineb)，(5.022)益穗(ziram)，(5.023)6-乙基-5,7-二側氧基-6,7-二氫-5H-吡咯并[3',4':5,6][1,4]二硫雜環己烯并[2,3-c][1,2]噻唑-3-甲腈。

6) 可誘發宿主防禦性之化合物，例如：(6.01)阿拉酸式苯(acibenzolar)-S-甲基，(6.002)異噻菌胺(isotianil)，(6.003)撲殺熱(probenazole)，(6.004)噻醯菌胺(tiadinil)。

7) 胺基酸與/或蛋白質生物合成之抑制劑，例如：(7.001)嘧菌環胺(cyprodinil)，(7.002)賜黴素(kasugamycin)，(7.003)賜黴素鹽酸鹽水合物，(7.004)土黴素(oxytetracycline)，(7.005)派美尼(pyrimethanil)，(7.006)3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)喹啉。

8) ATP 生產抑制劑，例如：(8.001)矽硫吩(silthiofam)。

9) 細胞壁合成抑制劑，例如：(9.001)苯噻菌胺(benthiavalicarb)，(9.002)達滅芬(dimethomorph)，(9.003)氟嗎啉(flumorph)，(9.004)丙森辛(iprovalicarb)，(9.005)曼普胺(mandipropamid)，(9.006)丁吡嗎啉(pyrimorph)，(9.007)倍利芬(valifenalate)，(9.008)(2E)-3-(4-第三丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(嗎啉-4-基)丙-2-烯-1-酮，(9.009)(2Z)-3-(4-第三丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(嗎啉-4-基)丙-2-烯-1-酮。

10) 脂質與膜合成抑制劑，例如：(10.001)普拔克(propamocarb)，(10.002)普拔克鹽酸鹽，(10.003)脫克松(tolclofos-methyl)。

11) 黑色素生物合成抑制劑，例如：(11.001)三賽唑(tricyclazole)，(11.002) {3-甲基-1-[(4-甲基苯甲醯基)胺基]丁烷-2-基}胺甲酸 2,2,2-三氟乙基酯。

12) 核酸合成抑制劑，例如：(12.001)苯雙靈(benalaxyl)，(12.002)苯雙靈-M(benalaxyl-M)(克拉利(kiralaxyl))，(12.003)滅達樂(metalaxyl)，(12.004)滅達樂-M(metalaxyl-M)(甲雙靈(mefenoxam))。

13) 訊號轉導抑制劑，例如：(13.001)護汰寧(fludioxonil)，(13.002)依普同(iprodione)，(13.003)撲滅寧(procymidone)，(13.004)丙氧喹啉(proquinazid)，(13.005)快諾芬(quinoxyfen)，(13.006)免克寧(vinclozolin)。

14) 可作為去偶合劑之化合物，例如：(14.001)扶吉胺(fluzinam)，(14.002)敵蟎普(meptyldinocap)。

15) 選自下列各項所組成群組中之其他殺真菌劑：(15.001)離層酸，(15.002)佈生(benthizole)，(15.003)苯噻嘧嗪(bethoxazin)，(15.004)卡普黴素(capsimycin)，(15.005)香芹酮(carvone)，(15.006)喹啉甲硫胺酸鹽(chinomethionat)，(15.007)庫發尼(cufraneb)，(15.008)賽芬胺(cyflufenamid)，(15.009)克絕(cymoxanil)，(15.010)環丙磺草胺(cyprosulfamide)，(15.011)噻菌淨(flutianil)，(15.012)福賽得鋁(fosetyl-aluminium)，(15.013)福賽得鈣(fosetyl-calcium)，(15.014)福賽得鈉(fosetyl-sodium)，(15.015)異硫氰酸甲酯，(15.016)滅芬農(metrafenone)，(15.017)米德黴素(mildiomycin)，(15.018)納坦黴素(natamycin)，(15.019)二甲基二硫代胺甲酸鎳，(15.020)異丙基硝基太(nitrothal-isopropyl)，(15.021)草胺威(oxamocarb)，(15.022)氧硫普靈(oxathiapirolin)，(15.023)氧芬辛(oxyfenthiin)，(15.024)五氯酚與鹽類，(15.025)亞磷酸與其鹽類，(15.026)霜黴威乙腓酸鹽(propamocarb-fosetylalte)，(15.027)必伏農(pyriofenone)(克吩農(chlazafenon))，(15.028)地布洛(tebufloquin)，(15.029)克枯爛(tecloftalam)，(15.030)甲磺菌胺(tolnifanide)，(15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮，(15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮，(15.033) 2-(6-苯甲基吡啶-2-基)噻唑啉，(15.034) 達滅菌(dipymetitrone)，(15.035) 2-[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑

-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧)苯基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮，(15.036) 2-[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧)苯基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮，(15.037) 2-[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧)苯基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮，(15.038) 2-[6-(3-氟-4-甲氧基苯基)-5-甲基吡啶-2-基]喹啉，(15.039) 甲磺酸 2-[(5R)-3-[2-(1-{[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-5-基]-3-氯苯基酯，(15.040) 甲磺酸 2-[(5S)-3-[2-(1-{[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-5-基]-3-氯苯基酯，(15.041) 抑氟克(ipflufenquin)，(15.042) 2-{2-氟-6-[(8-氟-2-甲基喹啉-3-基)氧]苯基}丙烷-2-醇，(15.043) 氟噁靈(fluoxapiprolin)，(15.044) 甲磺酸 2-{3-[2-(1-{[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-5-基}苯基酯，(15.045) 2-苯基酚及鹽類，(15.046) 3-(4,4,5-三氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)喹啉，(15.047) 克伏靈(quinofumelin)，(15.048) 4-胺基-5-氟嘧啶-2-醇(互變異構形：4-胺基-5-氟嘧啶-2(1H)-酮)，(15.049) 4-側氧基-4-[(2-苯基乙基)胺基]丁酸，(15.050) 5-胺基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇，(15.051) 5-氯-N'-苯基-N'-(丙-2-炔-1-基)噻吩-2-亞硫羧基醯肼，(15.052) 5-氟-2-[(4-氟苯基)氧]嘧啶-4-胺，(15.053) 5-氟-2-[(4-甲基苯基)氧]嘧啶-4-胺，(15.054) 9-氟-2,2-二甲基-5-(喹啉-3-基)-2,3-二氫-1,4-苯并氧氮雜環庚三烯，(15.055) {6-[(1-{(Z)-(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亞甲基}胺基)氧]甲基]吡啶-2-基}胺甲酸丁-3-炔-1-基酯，(15.056) (2Z)-3-胺基-2-氰基-3-苯基丙烯酸乙酯，(15.057) 吩嗪-1-羧酸，(15.058) 3,4,5-三羥基苯甲酸丙酯，(15.059) 喹啉-8-醇，(15.060) 喹啉-8-醇硫酸鹽(2：1)，(15.061) {6-[(1-{(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亞甲基}胺基)氧]甲基]吡啶-2-基}胺甲酸第三丁酯，(15.062) 5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-[(4-甲基苯基)磺醯基]-3,4-二氫嘧啶-2(1H)-酮，(15.063) 胺基吡吩(aminopyrifin)，(15.064) (N'-[2-氯-4-(2-氟苯氧基)-5-甲基苯基]-N-乙基-N-甲基甲脒)，(15.065) (N'-(2-氯-5-

甲基-4-苯氧基苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒)，(15.066) (2-{2-[(7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基)氧]-6-氟苯基}丙烷-2-醇)，(15.067) (5-溴-1-(5,6-二甲基吡啶-3-基)-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉)，(15.068) (3-(4,4-二氟-5,5-二甲基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]吡啶-7-基)喹啉)，(15.069) (1-(4,5-二甲基-1H-苯并咪唑-1-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉)，(15.070) 8-氟-3-(5-氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)喹啉酮，(15.071) 8-氟-3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)喹啉酮，(15.072) 3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)-8-氟喹啉，(15.073) (N-甲基-N-苯基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醯胺)，(15.074) ({4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}胺甲酸甲基酯)，(15.075) (N-{4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}環丙烷甲醯胺)，(15.076) N-甲基-4-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醯胺，(15.077) N-[(E)-甲氧基亞胺基甲基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醯胺，(15.078) N-[(Z)-甲氧基亞胺基甲基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醯胺，(15.079) N-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]-環丙烷甲醯胺，(15.080) N-(2-氟苯基)-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醯胺，(15.081) 2,2-二氟-N-甲基-2-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙醯胺，(15.082) N-烯丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]乙醯胺，(15.083) N-[(E)-N-甲氧基-C-甲基-亞胺羰基]-4-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)-苯甲醯胺，(15.084) N-[(Z)-N-甲氧基-C-甲基-亞胺羰基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醯胺，(15.085) N-烯丙基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]-甲基]丙醯胺，(15.086) 4,4-二甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡咯啉-2-酮，(15.087) N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]-苯硫代甲醯胺，(15.088) 5-甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡咯啉-2-酮，(15.089) N-((2,3-二氟-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基)甲基)-3,3,3-三氟-丙醯胺，(15.090) 1-甲氧基-1-甲基-3-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脒，(15.091) 1,1-二乙基-3-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脒，(15.092) N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙醯胺，(15.093)

N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]環丙烷甲醯胺，
 (15.094) 1-甲氧基-3-甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脲，
 (15.095) N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]環丙烷甲醯
 胺，(15.096) N,2-二甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙
 醯胺，(15.097) N-乙基-2-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]
 丙醯胺，(15.098) 1-甲氧基-3-甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]
 甲基]脲，(15.099) 1,3-二甲氧基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]
 脲，(15.100) 3-乙基-1-甲氧基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]
 脲，(15.101) 1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]哌啶-2-酮，(15.102)
 4,4-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]異噁唑啉-3-酮，
 (15.103) 5,5-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]異噁唑啉
 -3-酮，(15.104) 3,3-二甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]哌啶
 -2-酮，(15.105) 1-[[3-氟-4-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]氮雜環庚
 烷-2-酮，(15.106) 4,4-二甲基-2-[[4-(5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]
 異噁唑啉-3-酮，(15.107) 5,5-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]
 甲基]異噁唑啉-3-酮，(15.108) (1-{4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲
 基}-1H-吡唑-4-基)乙酸乙酯，(15.109) N,N-二甲基-1-{4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二
 唑-3-基]苯甲基}-1H-1,2,4-三唑-3-胺及(15.110) N-{2,3-二氟-4-[5-(三氟甲
 基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲基}丁醯胺。

作為混合組份之生物性殺蟲劑

【0103】 式(I)化合物可與生物性殺蟲劑組合。

【0104】 生物性殺蟲劑特定言之包括細菌、真菌、酵母、植物抽出物及由微
 生物形成之產物，包括蛋白質與二次代謝物。

【0105】 生物性殺蟲劑包括細菌，如：形成孢子之細菌、定殖在根部之細菌
 及具有生物性殺昆蟲劑、殺真菌劑或殺線蟲劑作用之細菌。

【0106】 此等已用為或可用為生物性殺蟲劑之細菌實例為：

液化澱粉芽孢桿菌(*Bacillus amyloliquefaciens*)菌株 FZB42 (DSM 231179)，或仙人掌桿菌(*Bacillus cereus*)，特定言之仙人掌桿菌(*B. cereus*)菌株 CNCM I-1562 或堅強芽孢桿菌(*Bacillus firmus*)菌株 I-1582 (登錄號 CNCM I-1582)或短小芽孢桿菌(*Bacillus pumilus*)，特定言之菌株 GB34 (登錄號 ATCC 700814)與菌株 QST2808 (登錄號 NRRL B-30087)，或枯草桿菌(*Bacillus subtilis*)，特定言之菌株 GB03 (登錄號 ATCC SD-1397)，或枯草桿菌(*Bacillus subtilis*)菌株 QST713 (登錄號 NRRL B-21661)或枯草桿菌(*Bacillus subtilis*)菌株 OST 30002 (登錄號 NRRL B-50421)、蘇雲金芽孢桿菌(*Bacillus thuringiensis*)，特定言之蘇雲金芽孢桿菌以色列亞種(*B. thuringiensis subspecies israelensis*)(血清型 H-14)，菌株 AM65-52 (登錄號 ATCC 1276)，或蘇雲金芽孢桿菌鮎澤亞種(*B. thuringiensis subsp. aizawai*)，特定言之菌株 ABTS-1857 (SD-1372)，或蘇雲金芽孢桿菌庫斯塔基亞種(*B. thuringiensis subsp. kurstaki*) 菌株 HD-1，或蘇雲金芽孢桿菌殺蟲亞種(*B. thuringiensis subsp. tenebrionis*)菌株 NB 176 (SD-5428)、穿刺巴斯德菌(*Pasteuria penetrans*)、巴斯德菌屬(*Pasteuria spp.*)(腎形腎狀線蟲(*Rotylenchulus reniformis*))-PR3 (登錄號 ATCC SD-5834)、細黃鏈黴菌(*Streptomyces microflavus*)菌株 AQ6121 (= QRD 31.013，NRRL B-50550)、鮮黃鏈黴菌(*Streptomyces galbus*)菌株 AQ 6047 (登錄號 NRRL 30232)。

【0107】 已用為或可用為生物性殺蟲劑之真菌及酵母實例為：

巴氏蠶白僵菌(*Beauveria bassiana*)，特定言之菌株 ATCC 74040；微坦盾殼黴(*Coniothyrium minitans*)，特定言之菌株 CON/M/91-8 (登錄號 DSM-9660)；輪枝菌屬(*Lecanicillium spp.*)，特定言之菌株 HRO LEC 12；蠟蚱輪枝菌(*Lecanicillium lecanii*) (過去稱為 *Verticillium lecanii*)，特定言之菌株 KV01；黑殭菌(*Metarhizium anisopliae*)，特定言之菌株 F52 (DSM3884/ ATCC 90448)；核果梅奇酵母(*Metschnikowia fructicola*)，特定言之菌株 NRRL Y-30752；玫煙色擬青黴(*Paecilomyces fumosoroseus*) (新名稱：玫煙色棒束孢(*Isaria fumosorosea*))，特定

言之菌株 IFPC 200613，或菌株 Apopka 97 (登錄號 ATCC 20874)；淡紫色擬青黴 (*Paecilomyces lilacinus*)，特定言之淡紫色擬青黴(*P. lilacinus*)菌株 251 (AGAL 89/030550)；大孢籃狀菌(*Talaromyces flavus*)，特定言之菌株 V117b；深綠木黴 (*Trichoderma atroviride*)，特定言之菌株 SC1 (登錄號 CBS 122089)；哈茨木黴 (*Trichoderma harzianum*)，特定言之哈茨木黴(*T. harzianum rifai*)T39 (登錄號 CNCM I-952)。

【0108】 已用為或可用為生物性殺蟲劑之病毒實例為：

小角紋捲葉蛾(*Adoxophyes orana*)(小食心蟲)顆粒體病毒(GV)、蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella*)顆粒體病毒(GV)、番茄夜蛾(*Helicoverpa armigera*)(棉鈴蟲)核型多角體病毒(NPV)、甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua*) mNPV、草地斜紋夜蛾(*Spodoptera frugiperda*)(秋行軍蟲)mNPV、棉貪夜蛾(*Spodoptera littoralis*)(非洲棉夜蛾)NPV。

【0109】 亦包括以細菌與真菌作為「接種菌」加至植物或植株部分或植物器官中，並利用其特殊性質，促進植物生長與植物健康。可述及之實例為：

土壤桿菌屬(*Agrobacterium spp.*)、甘藍固氮根瘤菌(*Azorhizobium caulinodans*)、固氮螺菌屬(*Azospirillum spp.*)、固氮菌屬(*Azotobacter spp.*)、慢生根瘤菌屬(*Bradyrhizobium spp.*)、伯克氏菌屬(*Burkholderia spp.*)(特定言之洋蔥伯克氏菌(*Burkholderia cepacia*)(過去稱為洋蔥假單胞菌(*Pseudomonas cepacia*)))、巨孢球囊黴屬(*Gigaspora spp.*)或單孢巨孢球囊黴(*Gigaspora monosporum*)、菌根菌屬(*Glomus spp.*)、蠟蘑菌屬(*Laccaria spp.*)、布氏乳桿菌(*Lactobacillus buchneri*)、類球囊黴屬(*Paraglomus spp.*)、豆包菌(*Pisolithus tinctorus*)、假單胞菌屬(*Pseudomonas spp.*)、根瘤菌屬(*Rhizobium spp.*)(特定言之三葉草根瘤菌(*Rhizobium trifolii*))、松露屬(*Rhizopogon spp.*)、硬皮馬勃菌屬(*Scleroderma spp.*)、乳牛肝菌屬(*Suillus spp.*)、鏈黴菌屬(*Streptomyces spp.*)。

【0110】 已用為或可用為生物性殺蟲劑之植物萃取物及由微生物形成之產物(包括蛋白質與二次代謝物)實例為：

大蒜(*Allium sativum*)、中亞苦蒿(*Artemisia absinthium*)、印楝素(*azadirachtin*)、Biokeeper WP、肉桂(*Cassia nigricans*)、苦皮藤(*Celastrus angulatus*)、臭杏(*Chenopodium anthelminticum*)、幾丁質、Armour-Zen、歐洲鱗毛蕨(*Dryopteris filix-mas*)、問荊草(*Equisetum arvense*)、Fortune Aza、Fungastop、Heads Up (藜麥(*Chenopodium quinoa*)皂苷抽出物)、除蟲菊/除蟲菊酯、苦木(*Quassia amara*)、櫟屬(*Quercus*)、皂樹(*Quillaja*)、虎杖抽出物(*Regalia*)、「Requiem™ Insecticide」殺昆蟲劑、魚藤酮(*rotenone*)、魚尼丁(*ryania*)/雷諾丁(*ryanodine*)、聚合草(*Symphytum officinale*)、菊蒿(*Tanacetum vulgare*)、百里酚、Triact 70、TriCon、金蓮花(*Tropaeolum majus*)、大蓴麻(*Urtica dioica*)、藜蘆鹼(*Veratrin*)、槲寄生(*Viscum album*)、十字花科抽出物，特定言之油菜籽粉或芥末粉，及得自橄欖油之生物性殺昆蟲/殺蟬蟎活性物質，特定言之包含具有碳原子鏈長 C_{16} - C_{20} 之不飽和脂肪酸/羧酸作為活性成份之產品，如，例如：商標名稱 FLiPPER®。

作為混合組份之安全劑

【0111】 式(I)化合物可與安全劑組合，如，例如：解草酮(*benoxacor*)、解毒啞(*cloquintocet (-mexyl)*)、解草胺腈(*cyometrinil*)、環丙磺草胺(*cyprosulfamide*)、二氯丙烯胺(*dichlormid*)、解草啞(*fenchlorazole(-ethyl)*)、解草啞(*fencloirim*)、解草安(*flurazole*)、氟草肟(*fluxofenim*)、解草啞啞(*furilazole*)、雙苯啞啞酸(*isoxadifen(-ethyl)*)、吡啞解草酯(*mefenpyr (-diethyl)*)、萘甲酸酐、解草腈(*oxabetrinil*)、2-甲氧基-N-({4-[(甲基胺甲醯基)胺基]苯基}磺醯基)苯甲醯胺(CAS 129531-12-0)、4-(二氯乙醯基)-1-氧雜-4-氮雜螺[4.5]癸烷(CAS 71526-07-3)、2,2,5-三甲基-3-(二氯乙醯基)-1,3-啞啞啞(CAS 52836-31-4)。

植物與植株部份

【0112】 所有植物與植株部份均可根據本發明處理。此時，咸了解植物係指所有植物及植株部份，如：需要及不需要之野生植物或作物(包括天然作物)，例

如：穀類(小麥、稻、硬粒小麥、大麥、裸麥、燕麥)、玉米、大豆、馬鈴薯、甜菜、甘蔗、番茄、甜椒、胡瓜、甜瓜、胡蘿蔔、西瓜、洋蔥、萵苣、菠菜、大蔥、豆類、十字花科蔬菜(*Brassica oleracea*)(例如：捲心白菜)與其他蔬菜類、棉花、菸草、油菜、與果實植物(果實為蘋果、梨、柑橘類水果與葡萄)。作物可為得自依傳統育種法與最適化方法或利用生物技術與遺傳工程法或此等方法之組合所取得者，包括基因轉殖植物，及包括受植物育種者權益保護或未受保護之植物栽培品種。咸了解，植物意指所有發展階段，如：種子、幼苗、幼株(未成熟)直到成熟植物。應咸了解，植株部份意指植物之所有地上及地下部份與器官，如：芽、葉、花與根，其實例可述及：闊葉、針葉、莖、樹幹、花、果實體、果實與種子，及球莖、根、與根莖。植株部份亦包括收成之植物或收成之植株部份，及無性與有性繁殖材料，例如：扦插、球莖、根莖、插枝與種子

【0113】 根據本發明使用式(I)化合物處理植物與植株部份之方法係依習用之處理法直接處理或使化合物作用在其周圍、環境或庫存空間，例如：浸泡、噴灑、蒸發、霧化、撒播、塗刷、注射，且若處理繁殖材料時，尤其處理種子時，亦可施加一層或多層包衣。

【0114】 如上述，根據本發明可處理所有植物與其部份植株。較佳實施例中，係處理野生植物品種與植物栽培品種，或彼等由傳統生物育種法(如：交配法或原生質融合法)取得者，與其部份植株。另一項較佳實施例中，係處理由遺傳工程方法(若適當時，可併用傳統方法)得到之基因轉殖植物與植物栽培品種(基因改造生物)，及其部份植株。術語「部份」或「植株部份」或「部份植株」已如上述說明。本發明特別佳者係處理自商品取得或使用中之植物栽培品種之植物。咸了解，植物栽培品種意指經由傳統育種法、誘變法或重組DNA技術得到之具有新穎性質(「性狀」)之植物。其等可為栽培品種、變異種、生物型或基因型。

基因轉殖植物、種子處理法與整合品項

【0115】 根據本發明，式(I)化合物宜用於處理彼等已接受可對此等植物、或植物栽培品種或植株部份賦與有利及/或適用性質(「性狀」)之遺傳材料之基因轉殖植物、或植物栽培品種或植株部份。因此本發明可以組合一或多種重組性狀或基因轉殖品項或其組合。基於此應用目的，由特定重組DNA分子嵌入植物基因體之染色體內特定位置(基因座)，製造基因轉殖品項。此嵌入結果產生新穎之DNA序列，稱為「品項」，其特徵在於嵌入之重組DNA分子及含有一些基因體DNA緊鄰/側接所嵌入DNA之兩端。此等性狀或基因轉殖品項包括(但不限於)：害蟲抗性、水利用效率、產量性能、耐旱性、種子品質、改善營養品質、產生雜交種子、及除草劑耐受性，其中該性狀係相對於缺乏此等性狀或基因轉殖品項之植物來測定。此等有利及/或適用性質(「性狀」)之具體實例為改善植物生長、活力、逆境壓力耐受性、直立性、抗倒伏性、營養素吸收性、植物營養、及/或產量，特定言之改善生長、提高對高溫或低溫之耐受性、提高對乾旱或對水含量或土壤鹽含量之耐受性、提高開花率、簡化收成、加速成熟、提高產量、提高所收成產品之品質與/或提高營養價值、所收成產品之更佳儲存壽命與/或提高可加工性，及提高對抗諸如：昆蟲、蛛形類、線蟲、蟎類、蛭蟪與蝸牛等有害動物及微生物之抗性或耐受性。

【0116】 編碼賦與針對此等有害動物與微生物(特定言之昆蟲)之抗性或耐受性之蛋白質之DNA序列中，可特別述及來自蘇雲金芽胞桿菌(*Bacillus thuringiensis*)之編碼Bt蛋白質之遺傳材料，其已廣泛說明於文獻中且係習此相關技藝者習知。亦可述及從細菌抽出之蛋白質，如：光桿菌(*Photobacterium*)(WO97/17432及WO98/08932)。特定言之，可述及Bt Cry或VIP蛋白質，其包括CryIA、CryIAb、CryIAc、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c Cry2Ab、Cry3Bb及CryIF蛋白質或其毒性片段及雜合物或其組合，特別係CryIF蛋白質或衍生自CryIF蛋白質之雜合物(例如：雜合CryIA-CryIF蛋白質或其毒性片段)、CryIA-型蛋白質或其毒性片段，較佳為CryIAc蛋白質或衍生自CryIAc蛋白質之雜合物(例如：雜合CryIAb-CryIAc蛋白質)或CryIAb或Bt2蛋白質或其毒性片段、

Cry2Ae、Cry2Af或Cry2Ag蛋白質或其毒性片段、Cry1A.105蛋白質或其毒性片段、VIP3Aa19蛋白質、VIP3Aa20蛋白質、VIP3A蛋白質(由COT202或COT203棉花品項產生)、VIP3Aa蛋白質或其毒性片段(其說明於Estruch等人(1996)之Proc Natl Acad Sci US A. 28;93(11):5389-94)、Cry蛋白質(其說明於WO2001/47952)、來自異發光桿菌(*Xenorhabdus*)之殺昆蟲蛋白質(其說明於WO98/50427)、沙雷氏菌(*Serratia*)(特別來自嗜蟲沙雷氏菌(*S. entomophila*))或光桿菌(*Photorhabdus*)屬菌株，如：WO98/08932中說明之來自光桿菌之Tc-蛋白質。本文亦包括此等蛋白質中任一種之變異體或突變體，其中有些胺基酸(1-10個，較佳為1-5個)與上述任一序列，特定言之與其毒性片段序列出現差異，或其等係與信號肽(transit peptide)，如：色素體信號肽(plastid transit peptide)，或另一種蛋白質或肽融合。

【0117】 另一種及特別強調之此等性質實例為賦與針對一或多種除草劑之耐受性，例如：咪唑啉酮類、磺胺脲類、嘉磷塞(glyphosate)或草胺磷(phosphinothricin)。在轉化之植物細胞及植物中編碼賦與針對某些除草劑之耐受性性質之蛋白質之DNA序列可特別述及bar或PAT基因或天藍色鏈黴菌(*Streptomyces coelicolor*)基因(其說明於WO2009/152359)，其賦與針對固殺草(glufosinate)除草劑之耐受性；編碼合適EPSPS(5-烯醇丙酮基紫草酸酯-3-磷酸-合成酶)之基因，其賦與針對以EPSPS為標靶之除草劑，特定言之如：嘉磷塞及其鹽類之除草劑之耐受性；編碼嘉磷塞-n-乙醯基轉化酶之基因；或編碼嘉磷塞氧化還原酶之基因。其他合適之除草劑耐受性性狀包括至少一種ALS(乙醯乳酸合成酶)抑制劑(例如：WO2007/024782)、突變之阿拉伯芥(*Arabidopsis*)ALS/AHAS基因(例如：美國專利案6,855,533)；編碼2,4-D-單氧合酶之基因，其賦與針對2,4-D (2,4-二氯苯氧基乙酸)之耐受性；及編碼麥草畏(Dicamba)單氧合酶之基因，其賦與針對麥草畏(Dicamba) (3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸)之耐受性。

【0118】 此等性質之其他及特別強調之實例為利用例如：後天取得之全株抗性(SAR)、系統素(systemin)、植物抗毒素(phytoalexins)、誘發素(elicitors)與抗性

基因，及相應表現之蛋白質與毒素，提高對抗植物病原性真菌、細菌及/或病毒之抗性。

【0119】 較佳可根據本發明處理之基因轉殖植物或植物栽培品種中之特別適用基因轉殖品項包括品項 531/ PV-GHBK04 (棉花，昆蟲防治，說明於 WO2002/040677)，品項 1143-14A (棉花，昆蟲防治，未寄存，說明於 WO2006/128569)；品項 1143-51B (棉花，昆蟲防治，未寄存，說明於 WO2006/128570)；品項 1445 (棉花，除草劑耐受性，未寄存，說明於 US-A 2002-120964 或 WO2002/034946)；品項 17053 (稻，除草劑耐受性，寄存於 PTA-9843，說明於 WO2010/117737)；品項 17314 (稻，除草劑耐受性，寄存於 PTA-9844，說明於 WO2010/117735)；品項 281-24-236 (棉花，昆蟲防治 - 除草劑耐受性，寄存於 PTA-6233，說明於 WO2005/103266 或 US-A 2005-216969)；品項 3006-210-23 (棉花，昆蟲防治 - 除草劑耐受性，寄存於 PTA-6233，說明於 US-A 2007-143876 或 WO2005/103266)；品項 3272 (玉米，品質性狀，寄存於 PTA-9972，說明於 WO2006/098952 或 US-A 2006-230473)；品項 33391 (小麥，除草劑耐受性，寄存於 PTA-2347，說明於 WO2002/027004)，品項 40416 (玉米，昆蟲防治 - 除草劑耐受性，寄存於 ATCC PTA-11508，說明於 WO 11/075593)；品項 43A47 (玉米，昆蟲防治 - 除草劑耐受性，寄存於 ATCC PTA-11509，說明於 WO2011/075595)；品項 5307 (玉米，昆蟲防治，寄存於 ATCC PTA-9561，說明於 WO2010/077816)；品項 ASR-368 (翦股穎，除草劑耐受性，寄存於 ATCC PTA-4816，說明於 US-A 2006-162007 或 WO2004/053062)；品項 B16 (玉米，除草劑耐受性，未寄存，說明於 US-A 2003-126634)；品項 BPS-CV127- 9 (大豆，除草劑耐受性，寄存於 NCIMB No. 41603，說明於 WO2010/080829)；品項 BLRI (油菜，恢復雄性不育性，寄存於 NCIMB 41193，說明於 WO2005/074671)，品項 CE43-67B (棉花，昆蟲防治，寄存於 DSM ACC2724，說明於 US-A 2009-217423 或 WO2006/128573)；品項 CE44-69D (棉花，昆蟲防治，未寄存，說明於 US-A 2010- 0024077)；品項 CE44-69D (棉花，昆蟲防治，未寄存，說明

於WO2006/128571)；品項CE46-02A (棉花，昆蟲防治，未寄存，說明於WO2006/128572)；品項COT102 (棉花，昆蟲防治，未寄存，說明於US-A 2006-130175或WO2004/039986)；品項COT202 (棉花，昆蟲防治，未寄存，說明於US-A 2007-067868或WO2005/054479)；品項COT203 (棉花，昆蟲防治，未寄存，說明於WO2005/054480)；品項DAS21606-3 / 1606 (大豆，除草劑耐受性，寄存於PTA-11028，說明於WO2012/033794)，品項DAS40278 (玉米，除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA-10244，說明於WO2011/022469)；品項DAS-44406-6 / pDAB8264.44.06.1 (大豆，除草劑耐受性，寄存於PTA-11336，說明於WO2012/075426)，品項DAS-14536-7 /pDAB8291.45.36.2 (大豆，除草劑耐受性，寄存於PTA-11335，說明於WO2012/075429)，品項DAS-59122-7 (玉米，昆蟲防治 - 除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA 11384，說明於US-A 2006-070139)；品項DAS-59132 (玉米，昆蟲防治 - 除草劑耐受性，未寄存，說明於WO2009/100188)；品項DAS68416 (大豆，除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA-10442，說明於WO2011/066384或WO2011/066360)；品項DP-098140-6 (玉米，除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA-8296，說明於US-A 2009- 137395或WO 08/112019)；品項DP-305423-1 (大豆，品質性狀，未寄存，說明於US-A 2008-312082或WO2008/054747)；品項DP-32138-1 (玉米，雜化系，寄存於ATCC PTA-9158，說明於US-A 2009-0210970或WO2009/103049)；品項DP-356043-5 (大豆，除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA-8287，說明於US-A 2010-0184079或WO2008/002872)；品項EE-I (茄子，昆蟲防治，未寄存，說明於WO 07/091277)；品項Fil 17 (玉米，除草劑耐受性，寄存於ATCC 209031，說明於US-A 2006-059581或WO 98/044140)；品項FG72 (大豆，除草劑耐受性，寄存於PTA-11041，說明於WO2011/063413)，品項GA21 (玉米，除草劑耐受性，寄存於ATCC 209033，說明於US-A 2005-086719或WO 98/044140)；品項GG25 (玉米，除草劑耐受性，寄存於ATCC 209032，說明於US-A 2005-188434或WO98/044140)；品項GHB119 (棉花，昆蟲防治 - 除草劑耐受性，寄存於ATCC

PTA-8398，說明於WO2008/151780)；品項GHB614 (棉花，除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA-6878，說明於US-A 2010-050282或WO2007/017186)；品項GJ11 (玉米，除草劑耐受性，寄存於ATCC 209030，說明於US-A 2005-188434或WO98/044140)；品項GM RZ13 (甜菜，病毒抗性，寄存於NCIMB-41601，說明於WO2010/076212)；品項H7-1 (甜菜，除草劑耐受性，寄存於NCIMB 41158或NCIMB 41159，說明於US-A 2004-172669或WO 2004/074492)；品項JOPLINI (小麥，病害耐受性，未寄存，說明於US-A 2008-064032)；品項LL27 (大豆，除草劑耐受性，寄存於NCIMB41658，說明於WO2006/108674或US-A 2008-320616)；品項LL55 (大豆，除草劑耐受性，寄存於NCIMB 41660，說明於WO 2006/108675或US-A 2008-196127)；品項LLcotton25 (棉花，除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA-3343，說明於WO2003/013224或US- A 2003-097687)；品項LLRICE06 (稻，除草劑耐受性，寄存於ATCC 203353，說明於US 6,468,747或WO2000/026345)；品項LLRice62 (稻，除草劑耐受性，寄存於ATCC 203352，說明於WO2000/026345)；品項LLRICE601 (稻，除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA-2600，說明於US-A 2008-2289060或WO2000/026356)；品項LY038 (玉米，品質性狀，寄存於ATCC PTA-5623，說明於US-A 2007-028322或WO2005/061720)；品項MIR162 (玉米，昆蟲防治，寄存於PTA-8166，說明於US-A 2009-300784或WO2007/142840)；品項MIR604 (玉米，昆蟲防治，未寄存，說明於US-A 2008-167456或WO2005/103301)；品項MON15985 (棉花，昆蟲防治，寄存於ATCC PTA-2516，說明於US-A 2004-250317或WO2002/100163)；品項MON810 (玉米，昆蟲防治，未寄存，說明於US-A 2002-102582)；品項MON863 (玉米，昆蟲防治，寄存於ATCC PTA-2605，說明於WO2004/011601或US-A 2006-095986)；品項MON87427 (玉米，授粉控制，寄存於ATCC PTA-7899，說明於WO2011/062904)；品項MON87460 (玉米，逆境壓力耐受性，寄存於ATCC PTA-8910，說明於WO2009/111263或US-A 2011-0138504)；品項MON87701 (大豆，昆蟲防治，寄存於ATCC PTA- 8194，

說明於US-A 2009-130071或WO2009/064652)；品項MON87705 (大豆，品質性狀 - 除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA-9241，說明於US-A 2010-0080887或WO2010/037016)；品項MON87708 (大豆，除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA-9670，說明於WO2011/034704)；品項MON87712 (大豆，產量，寄存於PTA-10296，說明於WO2012/051199)，品項MON87754 (大豆，品質性狀，寄存於ATCC PTA-9385，說明於WO2010/024976)；品項MON87769 (大豆，品質性狀，寄存於ATCC PTA- 8911，說明於US-A 2011-0067141或WO2009/102873)；品項MON88017 (玉米，昆蟲防治 - 除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA-5582，說明於US-A 2008-028482或WO2005/059103)；品項MON88913 (棉花，除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA-4854，說明於WO2004/072235或US-A 2006-059590)；品項MON88302 (油菜，除草劑耐受性，寄存於PTA-10955，說明於WO2011/153186)，品項MON88701 (棉花，除草劑耐受性，寄存於PTA-11754，說明於WO2012/134808)，品項MON89034 (玉米，昆蟲防治，寄存於ATCC PTA-7455，說明於WO 07/140256或US-A 2008-260932)；品項MON89788 (大豆，除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA-6708，說明於US-A 2006-282915或WO2006/130436)；品項MS1 1 (油菜，授粉控制 - 除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA-850或PTA-2485，說明於WO2001/031042)；品項MS8 (油菜，授粉控制 - 除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA-730，說明於WO2001/041558或US-A 2003-188347)；品項NK603 (玉米，除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA-2478，說明於US-A 2007-292854)；品項PE-7 (稻，昆蟲防治，未寄存，說明於WO2008/114282)；品項RF3 (油菜，授粉控制 - 除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA-730，說明於WO2001/041558或US-A 2003-188347)；品項RT73 (油菜，除草劑耐受性，未寄存，說明於WO2002/036831或US-A 2008-070260)；品項SYHT0H2 / SYN-000H2-5 (大豆，除草劑耐受性，寄存於PTA-11226，說明於WO2012/082548)，品項T227-1 (甜菜，除草劑耐受性，未寄存，說明於WO2002/44407或US-A 2009-265817)；品項T25 (玉米，除草劑耐受性，未寄

存，說明於US-A 2001-029014或WO2001/051654)；品項T304-40 (棉花，昆蟲防治 - 除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA-8171，說明於US-A 2010-077501或WO2008/122406)；品項T342-142 (棉花，昆蟲防治，未寄存，說明於WO2006/128568)；品項TC1507 (玉米，昆蟲防治 - 除草劑耐受性，未寄存，說明於US-A 2005-039226或WO2004/099447)；品項VIP1034 (玉米，昆蟲防治 - 除草劑耐受性，寄存於ATCC PTA-3925，說明於WO2003/052073)，品項32316 (玉米，昆蟲防治-除草劑耐受性，寄存於PTA-11507，說明於WO2011/084632)，品項4114 (玉米，昆蟲防治-除草劑耐受性，寄存於PTA-11506，說明於WO2011/084621)，品項EE-GM3 / FG72 (大豆，除草劑耐受性，ATCC登錄號N° PTA-11041) 視情況疊加品項EE-GM1/LL27或品項EE-GM2/LL55 (WO2011/063413A2)，品項DAS-68416-4 (大豆，除草劑耐受性，ATCC登錄號N° PTA-10442，WO2011/066360A1)，品項DAS-68416-4 (大豆，除草劑耐受性，ATCC登錄號N° PTA-10442，WO2011/066384A1)，品項DP-040416-8 (玉米，昆蟲防治，ATCC登錄號N° PTA-11508，WO2011/075593A1)，品項DP-043A47-3 (玉米，昆蟲防治，ATCC登錄號N° PTA-11509，WO2011/075595A1)，品項DP-004114-3 (玉米，昆蟲防治，ATCC登錄號N° PTA-11506，WO2011/084621A1)，品項DP-032316-8 (玉米，昆蟲防治，ATCC登錄號N° PTA-11507，WO2011/084632A1)，品項MON-88302-9 (油菜，除草劑耐受性，ATCC登錄號N° PTA-10955，WO2011/153186A1)，品項DAS-21606-3 (大豆，除草劑耐受性，ATCC登錄號No. PTA-11028，WO2012/033794A2)，品項MON-87712-4 (大豆，品質性狀，ATCC登錄號N°. PTA-10296，WO2012/051199A2)，品項DAS-44406-6 (大豆，疊加除草劑耐受性，ATCC登錄號N°. PTA-11336，WO2012/075426A1)，品項DAS-14536-7 (大豆，疊加除草劑耐受性，ATCC登錄號N°. PTA-11335，WO2012/075429A1)，品項SYN-000H2-5 (大豆，除草劑耐受性，ATCC登錄號N°. PTA-11226，WO2012/082548A2)，品項DP-061061-7 (油菜，除草劑耐受性，沒有寄存編號，WO2012071039A1)，品項

DP-073496-4 (油菜，除草劑耐受性，沒有寄存編號，US2012131692)，品項8264.44.06.1 (大豆，疊加除草劑耐受性，登錄號N° PTA-11336，WO2012075426A2)，品項8291.45.36.2 (大豆，疊加除草劑耐受性，登錄號N° PTA-11335，WO2012075429A2)，品項SYHT0H2 (大豆，ATCC登錄號N° PTA-11226，WO2012/082548A2)，品項MON88701 (棉花，ATCC登錄號N° PTA-11754，WO2012/134808A1)，品項KK179-2 (苜蓿，ATCC登錄號N° PTA-11833，WO2013/003558A1)，品項pDAB8264.42.32.1 (大豆，疊加除草劑耐受性，ATCC登錄號N° PTA-11993，WO2013/010094A1)，品項MZDT09Y (玉米，ATCC登錄號N° PTA-13025，WO2013/012775A1)。

【0120】 此外，此等基因轉殖品項列表係由美國農業部的動物及植物健康檢測局(the United States Department of Agriculture's (USDA) Animal and Plant Health Inspection Service (APHIS))提供，並可在全球資訊網的網站`aphis.usda.gov`上找到。本申請案中之此等列表與本申請案之申請日時之狀態相關。

【0121】 此等賦與所需性狀之基因/品項亦可相互組合進入基因轉殖植物中。可述及之基因轉殖植物實例包括重要作物，如：穀類(小麥、稻、硬粒小麥、大麥、裸麥、燕麥)、玉米、大豆、馬鈴薯、甜菜、甘蔗、番茄、豌豆及其他蔬菜品種、棉花、菸草、油菜與果實植物(果實為蘋果、梨、柑橘類水果與葡萄)，特別著重於玉米、大豆、小麥、稻、馬鈴薯、棉花、甘蔗、菸草與油菜。特別強調之性狀為提高植物對抗昆蟲、蛛形類、線蟲、蛭蟪與蝸牛之抗性，及提高植物對一或多種除草劑之耐受性。

【0122】 較佳採用根據本發明處理之自商品取得此等植物、植株部份或植物種子之實例包括由以下商品名稱出售或配送之商品，如：植物種子：GENUITY®、DROUGHTGARD®、SMARTSTAX®、RIB COMPLETE®、ROUNDUP READY®、VT DOUBLE PRO®、VT TRIPLE PRO®、BOLLGARD II®、ROUNDUP READY 2 YIELD®、YIELDGARD®、ROUNDUP READY® 2 XTEN^{DTM}、INTACTA RR2 PRO®、VISTIVE GOLD®、及/或XTENDFLEX™。

作物保護法—處理型態

【0123】 使用式(I)化合物處理植物與植株部份時，係採用習知處理法直接處理或作用在其周圍、棲息地或庫存空間，例如：浸泡、噴灑、噴霧、灌注、蒸發、撒粉、霧化、撒播、起泡、塗刷、散播、注射、澆水(澆淋)、滴灌，若處理繁殖材料時，特定言之處理種子時，亦可呈粉劑進行乾式種子處理法、呈溶液進行液體種子處理法、呈水溶性粉劑進行漿式處理法、包殼、塗佈一層或多層包衣，等等。亦可進一步採用超低體積法施用式(I)化合物或取施用型式或式(I)化合物本身注射至土壤中。

【0124】 植物之較佳直接處理法為葉部施用法，亦即讓式(I)化合物施用在葉部，其中處理頻率及施用率應配合所針對害蟲之感染程度來調整。

若為全株作用性活性化合物時，式(I)化合物亦可經由根系到達植物。因此可由式(I)化合物作用在植物所在地來處理植物。其作法可為例如：浸泡或混合至土壤或營養液中，亦即在植物所在地(例如：土壤或水耕系統)浸入液體型式之式(I)化合物，或藉由土壤施用法，亦即將根據本發明式(I)化合物以固體型式(例如：呈粒劑型式)加至植物所在地、或滴灌施用法(亦常稱為「灌溉施藥法(chemigation)」，亦即由根據本發明式(I)化合物液體與不同量的水一起從地表或地表下滴灌管線施用到植物周邊指定位置一段時間。若為水稻作物時，其作法為量取固體施用型式(例如：粒劑)之式(I)化合物加至水稻田中。

數位技術

【0125】 本發明化合物可能組合使用例如：植入電腦程式中之位置特異性作物管理、衛星遙測農作、精準農作或精準農業等模型。此等模型利用來自各種不同來源之數據，如：土壤、氣候、作物(例如：種類、生長期、植物健康)、雜草(例如：種類、生長期)、病害、有害生物、營養素、水、濕度、生物質、衛星數據、產量等等，支持定點專一性農業管理，目的在於優化盈利能力、永續性

及保護環境。特定言之，此等模型有助於優化農藝決策、控制農藥施用之精準性及記錄所執行之工作。

【0126】 例如：若建立害蟲之發展模型並計算建議施用本發明化合物至作物上已達到之閾值，則本發明化合物可以根據適當劑量方案施用至作物。

【0127】 可自商品取得之系統包括農藝模型，例如：來自Climate Corporation之FieldScripts™、來自BASF之Xarvio™、來自John Deere之AGLogic™，等等。

【0128】 本發明化合物亦可組合使用智慧型噴灑設備，如：例如：附接或安裝在農用機具內(如：曳引機、機器人、直昇機、飛機、無人飛行器(UAV)，如：無人機，等等)之定點噴灑或精準噴灑設備。此等設備通常包括輸入傳感器(如：例如：相機)及其組態在於分析輸入之數據並解算之處理器，依據所輸入數據分析來產生決策，依特定且精準方式施加本發明化合物至作物(或雜草)上。此等智慧型噴灑設備之用法通常亦需要定位系統(例如：GPS接收器)，來定位所記錄之數據，並引導或控制農用機具；以地理資訊系統(GIS)代表明顯易懂之地圖資訊，並以適當農用機具執行所需之農業操作，如：噴灑。

【0129】 例如：可以從相機取得的影像檢測害蟲。例如：可以依據該影像判定害蟲及/或分類。此等判定及/或分類可以利用圖像處理演算法來執行。該圖像處理演算法可以利用機器學習演算法，如：訓練神經網路、決策樹，及利用人工智慧演算法。依此方式可以僅依需要施加本文說明之化合物。

種子處理法

【0130】 長久以來已知藉由處理植物種子來防治動物害蟲且仍為持續改良的課題。然而，處理種子時，經常出現一系列無法以令人滿意之方式解決之問題。因此需要發展一種保護種子及發芽植物之方法，其可以在儲存期間、播種後或植物出土後免除或至少顯著減少另外施用殺蟲劑。亦需要使活性化合物以最適當用量提供種子及發芽植物最佳保護程度，以免動物害蟲侵害，但不讓所使用活性化合物傷害植物本身。特定言之，處理種子之方法亦應考量可抵抗或耐受

害蟲之基因轉殖植物固有之殺昆蟲或殺線蟲性質，以便在最低之殺蟲劑用量下，對種子及發芽植物達最佳保護程度。

【0131】 本發明因此特定言之，亦有關使用一種式(I)化合物處理種子，以保護種子與發芽植物免於害蟲侵害之方法。根據本發明保護種子與發芽植物對抗害蟲侵害之方法進一步包括以式(I)化合物與混合組份在一次操作中同時處理或依序處理之方法。亦包括以式(I)化合物與混合組份在不同時間處理種子之方法。

【0132】 本發明同樣係有關一種以式(I)化合物於處理種子上之用途，以保護種子與所長成植物免於動物害蟲侵害。

【0133】 本發明進一步有關一種已經過根據本發明式(I)化合物處理之種子，以保護免於動物害蟲侵害。本發明亦有關一種經過式(I)化合物與混合組份同時處理之種子。本發明進一步有關一種經過式(I)化合物與混合組份在不同時間點處理之種子。若為經過式(I)化合物與混合組份在不同時間點處理之種子時，該等個別物質可存在於種子之不同覆層中。此時，包含式(I)化合物之覆層與包含混合組份之覆層可視需要利用中間層分隔。本發明亦有關一種已經過式(I)化合物與混合組份作為包衣之組份或作為包衣以外之另一層或多層包覆之種子。

【0134】 本發明進一步有關一種種子，其在經過式(I)化合物處理後，再經過包膜衣製程，以防止種子被塵粉磨損。

【0135】 當式(I)化合物具全株作用性時，其優點之一在於經過處理之種子不僅可保護種子本身，而且可保護種子出土後所長成植株，對抗動物害蟲侵害。依此方式，即不需要在播種時或播種後短時間內立即處理作物。

【0136】 另一項優點在於使用式(I)化合物處理種子，可促進該經過處理之種子發芽及出土。

【0137】 同樣可視為優點之處在於式(I)化合物亦可特別用於基因轉殖種子。

【0138】 此外，式(I)化合物亦可與訊號轉導技術之組成物或化合物組合使用，結果可以改善與共生菌(如，例如：根瘤菌、菌根菌與/或內生細菌或真菌)之定殖，及/或達最佳固氮作用。

【0139】 式(I)化合物適合保護任何用於農業、溫室、森林或園藝之植物栽培品種之種子。特定言之，其係指穀類(例如：小麥、大麥、裸麥、小米與燕麥)、玉米、棉花、大豆、稻、馬鈴薯、葵花、咖啡、菸草、芥花、油菜、甜菜(例如：製糖用甜菜與飼料用甜菜)、花生、蔬菜(如：番茄、胡瓜、豆、十字花科蔬菜、洋蔥與萵苣)、果實植物、草皮與觀賞植物等之種子。特別重要為處理穀類(如：小麥、大麥、裸麥與燕麥)、玉米、大豆、棉花、芥花、油菜、蔬菜與稻之種子。

【0140】 亦如上述，式(I)化合物對基因轉殖種子之處理法亦特別重要。此時涉及之植物種子通常包含至少一種可以控制具有特定殺昆蟲性質與/或殺線蟲性質之多肽表現之異源基因。該基因轉殖種子中之此等異源基因可源自下列微生物，如：芽胞桿菌(*Bacillus*)、根瘤菌(*Rhizobium*)、假單胞菌(*Pseudomonas*)、沙雷氏菌(*Serratia*)、木黴(*Trichoderma*)、棒形桿菌(*Clavibacter*)、菌根菌(*Glomus*)或黏帚黴(*Gliocladium*)。本發明特別適合處理包含至少一種來自芽胞桿菌屬(*Bacillus sp.*)之異源基因之基因轉殖種子。特別佳為該異源基因係來自蘇雲金芽胞桿菌(*Bacillus thuringiensis*)。

【0141】 本發明內容中，式(I)化合物係施用至種子上。接受處理之種子最好處於充份穩定狀態，以免在處理過程中損傷。通常，可在收穫至播種期間任何時間點處理種子。所採用之種子通常已與植株分離且已脫除軸、殼、稈、包衣、穗或果肉。例如：可採用已經過採收、清潔且乾燥至可以儲存之水份含量之種子。或者亦可使用乾燥後再例如：經過水處理後再度乾燥之種子，例如：底層處理。處理稻種子時，亦可使用例如：已吸水至稻胚胎特定階段(雞胸型階段(pigeon breast stage))之種子，以刺激發芽及較一致之出土。

【0142】 當處理種子時，通常必需小心選擇施用至種子之式(I)化合物與/或其他添加劑之施用量，以免負面影響種子發芽，或不致於傷害所長成之植物。尤其當活性化化合物在特定施用率下可能具有植物毒性時，必需確保此點。

【0143】 通常，式(I)化合物係呈合適調配物形式施用至種子上。處理種子之合適調配物與方法係習此相關技藝之人士習知者。

【0144】 式(I)化合物可轉換成常用拌種調配物，如：溶液、乳液、懸浮液、粉劑、發泡劑、漿物或種子之其他包衣組成物，與ULV調配物。

【0145】 此等調配物可依已知方式製造，混合式(I)化合物與常用之添加劑，如，例如：常用之補充劑，及溶劑或稀釋劑、著色劑、濕化劑、勻散劑、乳化劑、消泡劑、防腐劑、二次增稠劑、膠黏劑、赤黴素，及水。

【0146】 根據本發明可使用之拌種調配物中可包含之著色劑為此等目的常用之所有著色劑。可使用難溶於水之色素，或可使用水溶性染劑。其實例包括彼等已知名稱為若丹明B(Rhodamin B)、C.I.紅色素(Pigment Red)112號與C.I.溶劑紅(Solvent Red)1號之染劑。

【0147】 根據本發明可使用之拌種調配物中可包含之適用濕化劑為可促進濕化及調配農化活性化合物時常用之所有物質。較佳為使用萘磺酸烷基酯類，如：萘磺酸二異丙基酯或萘磺酸二異丁基酯。

【0148】 根據本發明可使用之拌種調配物中可包含之適用勻散劑與/或乳化劑為調配農化活性成份時常用之所有非離子性、陰離子性與陽離子性勻散劑。較佳為使用非離子性或陰離子性勻散劑或非離子性或陰離子性勻散劑之混合物。合適之非離子性勻散劑尤其包括環氧乙烷/氧化丙烯嵌段聚合物、烷基苯酚聚二醇醚與三苯乙烯苯酚聚二醇醚，及其磷酸化或硫酸化衍生物。合適之陰離子性勻散劑尤其指木質素磺酸鹽、聚丙烯酸鹽、及芳基磺酸鹽/甲醛縮合物。

【0149】 根據本發明可使用之拌種調配物中可包含之消泡劑為調配農化活性成份時常用之所有抑制泡沫物質。較佳為使用聚矽氧消泡劑與硬脂酸鎂。

【0150】 根據本發明可使用之拌種調配物中可包含之防腐劑為農化組成物中為了此等目的常用之所有物質。其實例包括二氯吩(dichlorophen)與苯甲醇半縮甲醛。

【0151】 根據本發明可使用之拌種調配物中可包含之二次增稠劑為農化組成物中為了此等目的常用之所有物質。較佳為纖維素衍生物、丙烯酸衍生物、黃原膠、改質黏土與高分散性矽石。

【0152】 根據本發明可使用之拌種調配物中可包含之適用膠黏劑為拌種產品中所有常用之結合劑。較佳者可述及聚乙烷基吡咯啉酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙稀醇，與纖維基乙酸鈉(tylose)。

【0153】 根據本發明可使用之拌種調配物中可包含之赤黴素較佳為赤黴素A1、A3(=赤黴酸)、A4與A7；以使用赤黴酸特別佳。該赤黴素係已知者(參見R. Wegler 之Chemie der Pflanzenschutz- and Schädlingsbekämpfungsmittel, Vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412)。

【0154】 根據本發明可使用之拌種調配物可直接使用或加水稀釋後使用，用於處理各種不同種子。例如：該濃縮劑或其加水稀釋後所得之製劑可用於包覆穀類(如：小麥、大麥、裸麥、燕麥與硬粒小麥)之種子，及玉米、稻、油菜、豌豆、豆類、棉花、葵花、大豆及甜菜之種子，或各種不同蔬菜之種子。可根據本發明使用之拌種調配物或其稀釋之施用型式亦可用於包覆基因轉殖植物之種子。

【0155】 根據本發明可使用之拌種調配物或其加水製成之施用型式用於處理種子時，可使用所有常用於拌種之合適混合裝置。明確言之，進行該拌種過程時，將種子置入混合機中，依分批或連續操作方式，添加所需拌種調配物特定用量，可直接添加或先加水稀釋後添加，混合直到調配物均勻分佈在種子上為止。若適當時可接著進行乾燥過程。

【0156】 根據本發明可使用之拌種調配物之施用率可在相當大範圍內變化。其依據調配物中式(I)化合物之特定含量及依據種子而變化。式(I)化合物之施用率通常在每公斤種子0.001至50克之間，較佳為每公斤種子0.01至15克之間。

動物健康

【0157】 在動物健康領域(亦即獸醫學領域)，式(I)化合物可活性對抗動物寄生蟲，特定言之體外寄生蟲或體內寄生蟲。術語「體內寄生蟲」特定言之包括蠕

蟲與原蟲，如：球蟲(coccidia)。體外寄生蟲通常且較佳為節肢動物，特定言之昆蟲與蜱蟎類。

【0158】 在獸醫學領域中，對恆溫動物具有有利毒性之式(I)化合物適合在畜牧、養殖動物、動物園動物、實驗室動物、實驗動物與家畜動物中防治出現在動物養殖及動物畜養中之寄生蟲。其等可活性對抗寄生蟲之所有或特定發展階段。

【0159】 農業牲畜包括例如：哺乳動物，如：綿羊、山羊、馬、驢、駱駝、水牛、兔子、馴鹿、黠鹿及特定言之牛與豬；或禽類，如：火雞、鴨、鵝，及特定言之雞；或魚類與甲殼類，例如：水產養殖，或可能為昆蟲，如：蜜蜂。

【0160】 家畜動物包括例如：哺乳動物，如：倉鼠、天竺鼠，大鼠、小鼠、栗鼠、雪貂，或特定言之狗、貓、籠內的鳥；爬蟲類；兩棲類或水族箱內的魚。

【0161】 根據特定實施例，式(I)化合物係投與哺乳動物。

【0162】 根據另一項特定實施例，式(I)化合物係投與鳥類，亦即籠內的鳥，或特定言之禽類。

【0163】 使用式(I)化合物防治動物寄生蟲，係計畫降低或防止生病、死亡例及下降之效能(指肉品、乳品、毛、皮、蛋、蜂蜜，等等)，因此可以達到更經濟及更簡單之動物管理及更佳之動物效益。

【0164】 在動物健康之相關領域中，術語「防治」或「控制」係指式(I)化合物可有效降低各寄生蟲在感染此等寄生蟲之動物中之發病率，使此等寄生蟲降至無害程度。更明確言之，本文所採用之「防治」係指式(I)化合物可以有效殺死各寄生蟲、抑制其生長或抑制其繁殖。

【0165】 節肢動物實例包括(沒有任何限制)：

蝨目(Anoplurida)，例如：盲蝨屬(Haematopinus spp.)、長顎蝨屬(Linognathus spp.)、蝨蟎屬(Pediculus spp.)、陰蝨屬(Phtirus spp.)與管蝨屬(Solenopotes spp.)；

食毛目(Mallophagida)及鈍角亞目(Amblycerina)與細角亞目(Ischnocerina),例如:
羽蝨屬(Bovicola spp.)、食蟲虻屬(Damalina spp.)、貓羽蝨屬(Felicola spp.)、毛虱
屬(Lepikentron spp.)、雞蝨屬(Menopon spp.)、獸鳥蝨屬(Trichodectes spp.)、毛鳥
蝨屬(Trimenopon spp.)、巨毛蝨屬(Trinoton spp.)、嚼蝨屬(Werneckiella spp.) ;

雙翅目(Diptera)及長角亞目(Nematocerina)與短角亞目(Brachycerina),例如:伊
蚊屬(Aedes spp.)、按蚊屬(Anopheles spp.)、黃虻屬(Atylotus spp.)、蜂虱屬(Braula
spp.)、麗蠅屬(Calliphora spp.)、金蠅屬(Chrysomyia spp.)、斑虻屬(Chrysops spp.)、
庫蚊屬(Culex spp.)、蚊屬(Culicoides spp.)、真蚋屬(Eusimulium spp.)、廐蠅屬
(Fannia spp.)、胃蠅屬(Gasterophilus spp.)、舌蠅屬(Glossina spp.)、血蠅屬
(Haematobia spp.)、麻翅虻屬(Haematopota spp.)、蝨蠅屬(Hippobosca spp.)、瘤虻
屬(Hybomitra spp.)、齒股蠅屬(Hydrotaea spp.)、皮蠅屬(Hypoderma spp.)、蝨蠅屬
(Lipoptena spp.)、綠蠅屬(Lucilia spp.)、沙蠅屬(Lutzomyia spp.)、羊蝨蠅屬
(Melophagus spp.)、莫蠅屬(Morellia spp.)、家蠅屬(Musca spp.)、斑虻屬蚋屬
(Odagmia spp.)、狂蠅屬(Oestrus spp.)、Philipomyia屬、白蛉屬(Phlebotomus spp.)、
鼻狂蠅屬(Rhinoestrus spp.)、麻蠅屬(Sarcophaga spp.)、蚋蚊屬(Simulium spp.)、
螫蠅屬(Stomoxys spp.)、虻屬(Tabanus spp.)、大蚊屬(Tipula spp.)、維蚋屬
(Wilhelmia spp.)、肉蠅屬(Wohlfahrtia spp.) ;

蚤目(Siphonapterida),例如:角葉蚤屬(Ceratophyllus spp.)、櫛頭蚤屬
(Ctenocephalides spp.)、蚤屬(Pulex spp.)、潛蚤屬(Tunga spp.)、鼠蚤屬(Xenopsylla
spp.) ;

異翅目(Heteropterida),例如:臭蟲屬(Cimex spp.)、金圓蝽屬(Panstrongylus spp.)、
紅腹獵蝽屬(Rhodnius spp.)、錐蝽屬(Triatoma spp.) ; 及蜚蠊目(Blattaria)之擾人及
衛生害蟲。

【0166】 此外，節肢動物中，可述及例如(沒有任何限制)下列蜱蟲(Acari)：蜱蟲(Acari)之亞綱(蜱蟎亞綱(Acarina))及後氣亞目(Metastigmata)，例如：軟蜱科(Argasidae)，如：銳緣蜱屬(Argas spp.)、鈍緣蜱屬(Ornithodoros spp.)、殘緣蜱屬(Otobius spp.)；硬蜱科(Ixodidae)，如：花蜱屬(Amblyomma spp.)、革蜱屬(Dermacentor spp.)、血蜱屬(Haemophysalis spp.)、璃眼蜱屬(Hyalomma spp.)、硬蜱屬(Ixodes spp.)、扇頭蜱(Rhipicephalus(牛蜱(Boophilus))屬、扇頭蜱屬(Rhipicephalus spp.)(多重宿主蜱之原始屬種)；中氣亞目(Mesostigmata)，如：刺皮蟎屬(Dermanyssus spp.)、禽刺蟎屬(Ornithonyssus spp.)、肺刺蟎屬(Pneumonyssus spp.)、耳蟎屬(Raillietia spp.)、胸孔蟎屬(Sternostoma spp.)、Tropilaelaps 屬、瓦蟎屬(Varroa spp.)；光芒蟲亞目(Actinedida)(前氣亞目(Prostigmata))，例如：蜂蟎屬(Acarapis spp.)、姬蟎屬(Cheyletiella spp.)、脂蟎屬(Demodex spp.)、螯蟎屬(Listrophorus spp.)、肉蟎屬(Myobia spp.)、新恙蟎屬(Neotrombicula spp.)、禽螯蟎屬(Ornithocheyletia spp.)、綿羊疥蟎屬(Psorergates spp.)、恙蟎屬(Trombicula spp.)；及粉蟎亞目(Acaridida)(無氣亞目(Astigmata))，例如：粉蟎屬(Acarus spp.)、嗜木蟎屬(Caloglyphus spp.)、皮蟎屬(Chorioptes spp.)、雞蟎屬(Cytodites spp.)、皮頸下蟎屬(Hypodectes spp.)、鳥疥蟎屬(Knemidocoptes spp.)、雞雛蟎屬(Laminosioptes spp.)、耳蟎屬(Notoedres spp.)、耳蟎屬(Otodectes spp.)、癢蟎屬(Psoroptes spp.)、翼蟎屬(Pterolichus spp.)、疥蟎屬(Sarcoptes spp.)、疥癬恙蟲屬(Trixacarus spp.)、食酪蟎屬(Tyrophagus spp.)。

【0167】 寄生性原蟲實例包括(沒有任何限制)：鞭毛門(Mastigophora)(鞭毛動物綱(Flagellata))，如：

後滴門(Metamonada)：雙滴蟲目(Diplomonadida)，例如：賈第氏滴蟲屬(Giardia spp.)、旋核蟲屬(Spironucleus spp.)

副基體綱(Parabasala)：毛滴蟲目(Trichomonadida)，例如：組織鞭毛蟲屬(Histomonas spp.)、五毛滴蟲屬(Pentatrichomonas spp.)、四毛滴蟲屬(Tetratrichomonas spp.)、毛滴蟲屬(Trichomonas spp.)、三毛滴蟲屬(Tritrichomonas spp.)

眼蟲門(Euglenozoa)：錐蟲目(Trypanosomatida)，例如：利什曼原蟲屬(Leishmania spp.)、錐蟲屬(Trypanosoma spp.)

肉質鞭毛蟲門(Sarcomastigophora)((根足蟲綱(Rhizopoda))，如：內阿米巴科(Entamoebidae)(例如：阿米巴蟲屬(Entamoeba spp.))、阿米巴目(Centramoebidae)(例如：棘阿米巴屬(Acanthamoeba sp.))、真變形目(Euamoebidae)(例如：哈曼原蟲屬(Harmanella sp.))。

囊泡蟲總門(Alveolata)，如：頂複合器門(Apicomplexa)(孢子蟲綱(Sporozoa))，例如：隱孢子蟲屬(Cryptosporidium spp.)；艾美球蟲目(Eimeriida)，例如：貝斯諾孢子蟲屬(Besnoitia spp.)、囊等孢子球蟲屬(Cystoisospora spp.)、艾美球蟲屬(Eimeria spp.)、哈芒球蟲屬(Hammondia spp.)、等孢球蟲屬(Isospora spp.)、新孢子蟲屬(Neospora spp.)、肉孢子蟲屬(Sarcocystis spp.)、弓形蟲屬(Toxoplasma spp.)；住血孢子蟲目(Adeleida)，例如：肝簇蟲屬(Hepatozoon spp.)、球蟲屬(Klossiella spp.)；血孢子蟲目(Haemosporida)，例如：住白細胞原蟲屬(Leucocytozoon spp.)、鼠瘡原蟲屬(Plasmodium spp.)；梨形蟲目(Piroplasmida)，例如：焦蟲屬(Babesia spp.)、纖毛蟲屬(Ciliophora spp.)、Echinozoon 屬、泰勒蟲屬(Theileria spp.)；Vesiculiferida 目，例如：腸袋蟲屬(Balantidium spp.)、布克斯頓纖毛蟲屬(Buxtonella spp.)

微孢子亞門(Microspora)，如：微孢子蟲屬(Encephalitozoon spp.)、腸胞蟲屬(Enterocytozoon spp.)、球蟲屬(Globidium spp.)、微孢子蟲屬(Nosema spp.)、與例如：黏體動物門(Myxozoa spp.)。

成為人類或動物之致病性蠕蟲包括例如：棘頭動物(acanthocephala)、線蟲動物(nematodes)、舌形動物(pentastoma)與扁形動物門(platyhelminthe) (例如：單殖吸蟲(monogenea)、條蟲(cestodes)與複殖吸蟲(trematodes))。

【0168】 蠕蟲實例包括(沒有任何限制)：

單殖吸蟲亞綱(Monogenea)：例如：指標蟲屬(Dactylogyrus spp.)、三代蟲屬(Gyrodactylus spp.)、小盤吸蟲屬(Microbothrium spp.)、多盤吸蟲屬(Polystoma spp.)、Troglecephalus 屬；

條蟲(Cestodes)：擬葉目(Pseudophyllidea)，例如：吸葉條蟲屬(Bothridium spp.)、廣節裂頭條蟲屬(Diphyllobothrium spp.)、大複殖門條蟲屬(Diplogonoporus spp.)、Ichthyobothrium 屬、舌狀條蟲屬(Ligula spp.)、裂頭條蟲屬(Schistocephalus spp.)、螺旋體蟲屬(Spirometra spp.)；

圓葉目(Cyclophyllida)，例如：安迪亞條蟲屬(Andyra spp.)、裸頭條蟲屬(Anoplocephala spp.)、無卵黃腺條蟲(Avitellina spp.)、伯特條蟲屬(Bertiella spp.)、錫帶條蟲屬(Cittotaenia spp.)、戴文條蟲屬(Davainea spp.)、迪克氏條蟲屬(Diochis spp.)、雙孔條蟲屬(Diplopylidium spp.)、瓜實條蟲屬(Dipylidium spp.)、棘球條蟲屬(Echinococcus spp.)、棘葉條蟲屬(Echinocotyle spp.)、瘍棘殼條蟲屬(Echinolepis spp.)、泡尾條蟲屬(Hydatigera spp.)、包膜條蟲屬(Hymenolepis spp.)、約優克斯條蟲屬(Joyeuxiella spp.)、中殖孔屬條蟲屬(Mesocetoides spp.)、莫尼茨條蟲屬(Moniezia spp.)、副裸頭條蟲屬(Paranoplocephala spp.)、雷氏條蟲屬(Railletina

spp.)、史提拉條蟲屬(*Stilesia* spp.)、條蟲屬(*Taenia* spp.)、曲子宮條蟲屬(*Thysaniezia* spp.)、隧體條蟲屬(*Thysanosoma* spp.)

複殖吸蟲(Trematodes): 複殖綱(Digenea), 例如: 澳畢吸蟲屬(*Austroilharzia* spp.)、短咽吸蟲屬(*Brachylaima* spp.)、杯殖吸蟲屬(*Calicophoron* spp.)、下彎吸蟲屬(*Catantropis* spp.)、支睪吸蟲屬(*Clonorchis* spp.)、肛瘤吸蟲屬(*Collyriclum* spp.)、盤吸蟲屬(*Cotylophoron* spp.)、環腸吸蟲屬(*Cyclocoelum* spp.)、雙腔吸蟲屬(*Dicrocoelium* spp.)、複口吸蟲屬(*Diplostomum* spp.)、棘隙吸蟲屬(*Echinochasmus* spp.)、棘緣吸蟲屬(*Echinoparyphium* spp.)、棘口吸蟲屬(*Echinostoma* spp.)、闊盤吸蟲屬(*Eurytrema* spp.)、肝吸蟲屬(*Fasciola* spp.)、擬片形吸蟲屬(*Fasciolides* spp.)、薑片蟲屬(*Fasciolopsis* spp.)、菲策吸蟲屬(*Fischioederius* spp.)、腹袋吸蟲屬(*Gastrothylacus* spp.)、巨畢吸蟲屬(*Gigantobilharzia* spp.)、巨盤吸蟲屬(*Gigantocotyle* spp.)、異形吸蟲屬(*Heterophyes* spp.)、低頸吸蟲屬(*Hypoderaeum* spp.)、彩蚴吸蟲屬(*Leucochloridium* spp.)、後殖吸蟲屬(*Metagonimus* spp.)、次睪吸蟲屬(*Metorchis* spp.)、隱孔吸蟲屬(*Nanophyetus* spp.)、背孔吸蟲屬(*Notocotylus* spp.)、後睪吸蟲屬(*Opisthorchis* spp.)、毛樣線蟲屬(*Ornithobilharzia* spp.)、並殖吸蟲屬(*Paragonimus* spp.)、雙口吸蟲屬(*Paramphistomum* spp.)、斜睪吸蟲屬(*Plagiorchis* spp.)、莖雙穴吸蟲屬(*Posthodiplostomum* spp.)、前殖吸蟲屬(*Prosthogonimus* spp.)、血吸蟲屬(*Schistosoma* spp.)、毛畢屬(*Trichobilharzia* spp.)、鮭吸蟲屬(*Troglootrema* spp.)、盲腔屬(*Typhlocoelum* spp.)

線蟲(Nematodes): 毛形亞目(*Trichinellida*), 例如: 毛細線蟲屬(*Capillaria* spp.)、優鞘線蟲屬(*Eucoleus* spp.)、毛細線蟲屬(*Paracapillaria* spp.)、旋毛蟲屬(*Trichinella* spp.)、線蟲屬(*Trichomosoides* spp.)、毛首線蟲屬(*Trichuris* spp.)

墊刃目 (Tylenchida)，例如：細頸線蟲屬 (*Micronema* spp.)、副糞桿線蟲屬 (*Parastrangyloides* spp.)、糞桿線蟲屬 (*Strongyloides* spp.)

小桿亞目 (Rhabditina)，例如：貓圓線蟲屬 (*Aelurostrongylus* spp.)、裂口線蟲屬 (*Amidostomum* spp.)、鉤蟲屬 (*Ancylostoma* spp.)、住血線蟲屬 (*Angiostrongylus* spp.)、*Bronchonema* 屬、仰口線蟲屬 (*Bunostomum* spp.)、腸線蟲屬 (*Chabertia* spp.)、古柏線蟲屬 (*Cooperia* spp.)、類古柏線蟲屬 (*Cooperioides* spp.)、環體線蟲屬 (*Crenosoma* spp.)、節蟲屬 (*Cyathostomum* spp.)、線蟲屬 (*Cyclococercus* spp.)、環齒口鉤蟲屬 (*Cyclodontostomum* spp.)、杯環線蟲屬 (*Cylicocyclus* spp.)、杯冠線蟲屬 (*Cylicostephanus* spp.)、柱咽線蟲屬 (*Cylindropharynx* spp.)、囊尾線蟲屬 (*Cystocaulus* spp.)、網尾線蟲屬 (*Dictyocaulus* spp.)、鹿圓線蟲屬 (*Elaphostrongylus* spp.)、類絲線蟲屬 (*Filaroides* spp.)、球首線蟲屬 (*Globocephalus* spp.)、毛樣線蟲屬 (*Graphidium* spp.)、輻首線蟲屬 (*Gyallocephalus* spp.)、血矛線蟲屬 (*Haemonchus* spp.)、螺旋線蟲屬 (*Heligmosomoides* spp.)、胃圓線蟲屬 (*Hyostrongylus* spp.)、馬歇爾線蟲屬 (*Marshallagia* spp.)、後圓線蟲屬 (*Metastrongylus* spp.)、繆勒線蟲屬 (*Muellerius* spp.)、鉤蟲屬 (*Necator* spp.)、細頸線蟲屬 (*Nematodirus* spp.)、新圓線蟲屬 (*Neoststrongylus* spp.)、日圓線蟲屬 (*Nippostrongylus* spp.)、尖頭胃線蟲屬 (*Obeliscoides* spp.)、食道齒線蟲屬 (*Oesophagodontus* spp.)、結線蟲屬 (*Oesophagostomum* spp.)、壺肛線蟲屬 (*Ollulanus* spp.)、圓蟲屬 (*Ornithostrongylus* spp.)、奧斯勒絲蟲屬 (*Oslerus* spp.)、胃絲蟲屬 (*Ostertagia* spp.)、副古柏線蟲屬 (*Paracooperia* spp.)、副環體線蟲屬 (*Paracrenosoma* spp.)、副類絲線蟲屬 (*Parafilaroides* spp.)、副麝圓線蟲屬 (*Parelaphostrongylus* spp.)、肺尾屬 (*Pneumocaulus* spp.)、肺圓線蟲屬 (*Pneumostrongylus* spp.)、盆口線蟲屬 (*Poteriostomum* spp.)、原圓線蟲屬 (*Protostrongylus* spp.)、指尾線蟲屬 (*Spicocaulus* spp.)、冠尾線蟲屬 (*Stephanurus* spp.)、圓線蟲屬 (*Strongylus* spp.)、比翼線蟲屬 (*Syngamus* spp.)、牛胃絲蟲屬 (*Teladorsagia* spp.)、毛線線蟲屬 (*Trichonema* spp.)、

毛圓線蟲屬(*Trichostrongylus* spp.)、三齒線蟲屬(*Triodontophorus* spp.)、隱圓屬(*Troglostrongylus* spp.)、彎口線蟲屬(*Uncinaria* spp.)

旋尾目(*Spirurida*)，例如：棘唇蟲屬(*Acanthocheilonema* spp.)、海獸胃線蟲屬(*Anisakis* spp.)、禽蛔屬(*Ascaridia* spp.)、蛔蟲屬(*Ascaris* spp.)、螺咽屬(*Ascarops* spp.)、無刺蟯蟲屬(*Aspiculuris* spp.)、貝利蛔蟲屬(*Baylisascaris* spp.)、布魯線蟲屬(*Brugia* spp.)、*Cercopithifilaria* 屬、寄生線蟲(*Crassicauda* spp.)、雙瓣線蟲屬(*Dipetalonema* spp.)、血直絲蟲屬(*Dirofilaria* spp.)、龍線蟲屬(*Dracunculus* spp.)、德拉西線蟲屬(*Draschia* spp.)、蟯蟲屬(*Enterobius* spp.)、絲蟲屬(*Filaria* spp.)、棘口線蟲屬(*Gnathostoma* spp.)、筒線蟲屬(*Gongylonema* spp.)、馬胃線蟲屬(*Habronema* spp.)、異刺線蟲屬(*Heterakis* spp.)、光絲蟲屬(*Litomosoides* spp.)、羅阿絲蟲屬(*Loa* spp.)、蟠尾絲蟲屬(*Onchocerca* spp.)、尖尾線蟲屬(*Oxyuris* spp.)、副柔絲線蟲屬(*Parabronema* spp.)、類絲蟲屬(*Parafilaria* spp.)、副蛔屬(*Parascaris* spp.)、栓尾線蟲屬(*Passalurus* spp.)、泡翼線蟲屬(*Physaloptera* spp.)、普氏線蟲屬(*Probstmayria* spp.)、假絲蟲屬(*Pseudofilaria* spp.)、絲狀線蟲屬(*Setaria* spp.)、*Skjrabinema* 屬、旋尾線蟲屬(*Spirocerca* spp.)、冠絲蟲屬(*Stephanofilaria* spp.)、圓蟲屬(*Strongyluris* spp.)、管狀線蟲屬(*Syphacia* spp.)、吸吮線蟲屬(*Thelazia* spp.)、弓蛔屬(*Toxascaris* spp.)、弓首線蟲屬(*Toxocara* spp.)、吳策線蟲屬(*Wuchereria* spp.)

棘頭動物(*Acanthocephala*)：少棘目(*Oligacanthorhynchida*)，例如：巨吻棘頭蟲屬(*Macracanthorhynchus* spp.)、前峯棘頭蟲屬(*Prosthenorchis* spp.)；念珠目(*Moniliformida*)，例如：聯珠狀棘頭蟲屬(*Moniliformis* spp.)

多形目(*Polymorphida*)，例如：細頸棘頭蟲屬(*Filicollis* spp.)；棘吻目(*Echinorhynchida*)，例如：棘頭蟲屬(*Acanthocephalus* spp.)、魚棘頭蟲屬(*Echinorhynchus* spp.)、似細吻棘頭蟲屬(*Leptorhynchoides* spp.)

舌形動物門(Pentastoma)：孔頭蟲目(Porocephalida)，例如：舌形蟲屬(Linguatula spp.)。

【0169】 在獸醫領域與動物飼養中，式(I)化合物係呈合適之製劑型式，採用相關技藝上已知方法投藥，如：經腸、非經腸式、經皮膚或經鼻途徑投藥。該投藥法可為預防性、補救性預防(metaphylactic)或治療性。

【0170】 因此，本發明一項實施例係有關以式(I)化合物作為醫藥使用。

【0171】 另一態樣係指以式(I)化合物作為抗體內寄生蟲劑使用。

【0172】 本發明另一特定態樣係指以式(I)化合物作為殺蠕蟲劑使用，更特定言之作為殺線蟲劑、殺扁平蠕蟲劑、殺棘頭蟲劑或殺舌形動物劑使用。

【0173】 本發明另一特定態樣係指以式(I)化合物作為抗原蟲劑使用。

【0174】 本發明另一態樣係指以式(I)化合物作為抗體外寄生蟲劑使用，特定言之殺節肢動物劑，更特定言之殺昆蟲劑或殺蜚蠊劑。

【0175】 本發明另一態樣係有關一種獸用調配物，其包含有效量之至少一種式(I)化合物與至少一種下列製劑：醫藥上可接受之賦形劑(例如：固態或液態稀釋劑)、醫藥上可接受之輔劑(例如：界面活性劑)，特定言之常用於獸用調配物中之醫藥上可接受之賦形劑與/或醫藥上可接受之輔劑。

【0176】 本發明一項相關態樣係一種製造本文所說明獸用調配物之方法，其包括混合至少一種式(I)化合物與醫藥上可接受之賦形劑與/或輔劑，特定言之常用於獸用調配物中之醫藥上可接受之賦形劑與/或輔劑之步驟。

【0177】 本發明另一特定態樣係一種選自殺體外寄生蟲與殺體內寄生蟲調配物之群中之獸用調配物，更特定言之係選自殺蠕蟲、抗原蟲與殺節肢動物調配物之群中，甚至更特定言之係選自根據上述態樣之殺線蟲、殺扁平蠕蟲、殺棘頭蟲、殺舌形動物、殺昆蟲與殺蜚蠊調配物之群中，及其製造方法。

【0178】 另一態樣係有關一種對有需要之動物(特定言之非人類動物)施用有效量之式(I)化合物，治療寄生蟲感染，特定言之因選自本文所述體外寄生蟲與體內寄生蟲之群組中之寄生蟲所引起之感染之方法。

【0179】 另一態樣係有關一種對有需要之動物(特定言之非人類動物)施用本文所定義之獸用調配物，治療寄生蟲感染，特定言之因選自本文所述體外寄生蟲與體內寄生蟲之群組中之寄生蟲所引起之感染之方法。

【0180】 另一態樣係有關一種以式(I)化合物於治療動物(特定言之非人類動物)之寄生蟲感染，特定言之因選自本文所述體外寄生蟲與體內寄生蟲之群組中之寄生蟲所引起之感染上之用途。

【0181】 在目前發明動物健康或獸醫學領域內容中，術語「處理(treatment)」包括預防性、補救性預防(metaphylactic)與治療性處理。

【0182】 在特定實施例中，本文為獸醫學領域提供至少一種式(I)化合物與其他活性成份(特定言之殺體內與體外寄生蟲劑)之混合物。

【0183】 在動物健康領域中，「混合物」不僅指兩種(或更多種)不同活性成份調配成同一調配物中，因此係共同施用，而且係有關一種包含各活性化合物之分開調配物之產品。因此，當施用兩種以上活性化合物時，所有活性化合物均調配成同一調配物或所有活性化合物可調配成分開調配物；同樣可理解之混合型式為其中有些活性化合物係共同調配，而有些活性化合物係分開調配。分開調配物可以分開或連續施用該相關活性化合物。

【0184】 本文中以其俗名稱呼之活性化合物為已知者且說明於例如：「The Pesticide Manual」(如上述)或可搜尋網際網路(例如：<http://www.alanwood.net/pesticides>)。

【0185】 作為混合對象之來自殺體外寄生蟲劑族群之活性成份實例包括(沒有限制)上文詳列之殺昆蟲劑及殺蜚蟻劑。其他可採用活性成份已依據上述目前「IRAC作用模式分類圖(IRAC Mode of Action Classification Scheme)」分類法詳細列出如下：(1) 乙醯基膽鹼酯酶(AChE)抑制劑；(2) GABA-閘控之氯離子通道

阻斷劑；(3) 鈉通道調控劑；(4) 菸鹼激導性乙醯基膽鹼受體(nAChR)競爭性調控劑；(5) 菸鹼激導性乙醯基膽鹼受體(nAChR)異位性調控劑；(6) 麩胺酸閘控氯離子通道(GluCl)異位性調控劑；(7) 幼保激素擬似物；(8) 其他非專一性(多重位點)抑制劑；(9) 弦音感覺器官通道調控劑；(10) 蟎生長抑制劑；(12) 粒線體ATP合成酶抑制劑，如：ATP瓦解劑；(13) 破壞質子梯度之氧化性磷酸化反應去偶合劑；(14) 菸鹼激導性乙醯基膽鹼受體通道阻斷劑；(15) 幾丁質生物合成抑制劑，第0型；(16) 幾丁質生物合成抑制劑，第1型；(17) 蛻變瓦解劑(特定言之雙翅目，亦即雙翅目昆蟲)；(18) 脫皮激素受體促效劑；(19) 章魚胺受體促效劑；(21) 粒線體複合物-I電子轉運抑制劑；(25) 粒線體複合物-II電子轉運抑制劑；(20) 粒線體複合物-III電子轉運抑制劑；(22) 依賴電壓之鈉通道阻斷劑；(23) 乙醯基-CoA羧酸酶之抑制劑；(28) 蘭尼鹼(ryanodine)受體調控劑；(30) GABA-閘控氯離子通道異位性調控劑。

【0186】 作用模式未知或非專一性之活性化合物，例如：吡氟草胺(fentrifanil)、抗蟎唑(fenoxacrim)、環普靈(cycloprene)、殺蟎酯(chlorobenzilate)、殺蟲脒(chlordimeform)、氟苯滅(flubenzimin)、地昔尼爾(dicyclanil)、艾滅得(amidoflumet)、滅蟎猛(quinomethionat)、苯蟎噻(triarathene)、氯噻苯(clothiazoben)、殺蟎好(tetrasul)、油酸鉀、石油、噁蟲酮(metoxadiazone)、葛昔普(gossyplur)、氟蟎嗪(flutenzine)、溴蟎酯(brompropylate)、克利得(cryolite)；

其他類別化合物，例如：畜蟲威(butacarb)、地麥威(dimetilan)、除線威(cloethocarb)、磷光威(phosphocarb)、亞特松(pirimiphos)(-乙基)、巴拉松(parathion)(-乙基)、蟲蟎畏(methacrifos)、鄰水楊酸異丙基酯、三氯松(trichlorfon)、塔格納(tigolaner)、硫丙磷(sulprofos)、丙蟲磷(propaphos)、硫線磷(sebufos)、吡硫磷(pyridathion)、發硫磷(prothoate)、除線磷(dichlofenthion)、滅賜松(demeton)-S-甲基磺、依殺松(isazofos)、苯腈磷(cyanofenphos)、氯亞胺硫磷(dialifos)、三硫磷(carbophenothion)、特硫磷(autathiofos)、愛吩磷(aromfenvinfos)(-甲基)、穀速松(azinphos)(-乙基)、陶

斯松(chlorpyrifos)(-乙基)、丁苯硫磷(fosmethilan)、丙胺磷(iodofenphos)、蔬果磷(dioxabenzofos)、福木松(formothion)、地蟲磷(fonofos)、吡氟硫磷(flupyrzofos)、繁福松(fensulfothion)、乙嘧硫磷(etrifos)；

有機氯化物，例如：毒殺芬(camphochlor)、林丹(lindane)、飛布達(heptachlor)；或苯基吡唑類，例如：乙醯蟲脞(acetoprole)、吡蟲脞(pyrafluprole)、吡啉蟲脞(pyriprole)、氟吡唑蟲(vaniliprole)、維吉黴素(sisapronil)；或異噁唑啉類，例如：賽蘭(sarolaner)、艾伏樂(afoxolaner)、樂地蘭(lotilaner)、氟樂(fluralaner)；

擬除蟲菊酯類，例如：(順式-、反式-)美特寧(metofluthrin)、丙氟菊酯(profluthrin)、三氟醚菊酯(flufenprox)、溴氟菊酯(flubrocycythrinate)、苧蟊醚(fubfenprox)、五氟菊酯(fenfluthrin)、普賽吩布(protrifenbut)、二氯苯醚菊酯(pyresmethrin)、RU15525、環戊烯丙菊酯(terallethrin)、順式-利滅靈(cis-resmethrin)、氯氟醚菊酯(heptafluthrin)、生物乙醚菊酯(bioethanomethrin)、生物氯菊酯(biopermethrin)、芬普寧(fenpyrithrin)、順式-賽滅寧(cis-cypermethrin)、順式-百滅寧(cis-permethrin)、功夫菊酯(clocythrins)、賽洛寧(cyhalothrin)(λ-)、氯波寧(chlovaporthrin)、或鹵化烴化合物(HCH)，

類新菸鹼，例如：硝蟲噻嗪(nithiazine)

二氯滅嗪(dicloromezotiaz)、三氟普靈(triflumezopyrim)

大環內酯類，例如：尼美克定(nemadectin)、抑伏克定(ivermectin)、拉替菌素(latidectin)、莫西克定(moxidectin)、希樂克定(selamectin)、普滅克定(eprinomectin)、得滅克定(doramectin)、抑滅克定(emamectin)苯甲酸鹽；美保黴素肟(milbemycin oxime)

硫烯酸酯(triprene)、保幼醌(epofenonane)、二苯丙醌(diofenolan)；

生物物質、激素、或費洛蒙類，例如：天然產物，例如：蘇力菌素(thuringiensin)、十二碳二烯醇(codlemone)或印楝組份

二硝基酚，例如：敵蟎普(dinocap)、敵蟎通(dinobuton)、樂殺蟎(binapacryl)；

苯甲醯脲類，例如：氟佐隆(fluzuron)、氟幼脲(penfluron)，

脘衍生物，例如：氯甲脘(chlormebuform)、蟎蜱胺(cymiazole)、得米地曲(demiditraz)，

蜂箱蜂蟹蟎殺蜱蟎劑，例如：有機酸類，例如：甲酸、草酸。

【0187】 選自殺體內寄生蟲劑群組作為混合對象之活性成份實例包括(沒有限制)：殺蠕蟲活性成份與抗原蟲活性化合物。

【0188】 殺蠕蟲活性化合物包括(沒有限制)：下列殺線蟲、殺白蟻與/或殺絛蟲活性化合物：

大環內酯類，例如：普滅克定(eprinomectin)、艾滅克定(abamectin)、尼美克定(nemadectin)、莫西克定(moxidectin)、得滅克定(doramectin)、希樂克定(selamectin)、利滅克定(lepimectin)、拉替菌素(latidectin)、美保克定(milbemectin)、抑伏克定(ivermectin)、抑滅克定(emamectin)、美保黴素(milbemycin)；

苯并咪唑類與聚苯并咪唑類(probenzimidazoles)，例如：歐苯達唑(oxibendazole)、美苯達唑(mebendazole)、三氯苯咪唑(triclabendazole)、多保淨(thiophanate)、帕苯達唑(parbendazole)、歐菲達唑(oxfendazole)、奈托比胺(netobimin)、菲苯達唑(fenbendazole)、非班太(febantel)、腐絕(thiabendazole)、環苯達唑(cyclobendazole)、卡苯達唑(cambendazole)、阿苯達唑(albendazole)-亞碲、阿苯達唑(albendazole)、伏苯達唑(flubendazole)；

縮酸肽類(depsipeptides)，較佳為環狀縮酸肽類，特定言之 24-員環狀縮酸肽類，例如：恩得肽(emodepside)、PF1022A；

四氫嘧啶類，例如：摩朗得(morantel)、噻嘧啶(pyrantel)、酚嘧啶(oxantel)；
咪唑并噻唑類，例如：丁咪唑(butamisole)、左旋咪唑(levamisole)、四咪唑(tetramisole)；

胺基苯基脒類，例如：阿米太爾(amidantel)、脫鹽基阿米太爾(amidantel) (dAMD)、三苯雙脒(tribendimidine)；

胺基乙腈類，例如：莫內太爾(monepantel)；

對郝喹醯胺類(paraherquamide)，例如：對郝喹醯胺(paraherquamide)、得曲恩特(derquantel)；

水楊醯替苯胺類，例如：三溴水楊胺(tribromsalan)、溴氟硝柳胺(bromoxanide)、溴替尼特(brotianide)、氯碘柳苯胺(clioxanide)、氯氰碘柳胺(closantel)、耐克螺(niclosamide)、氯脛柳胺(oxyclozanide)、碘醚柳胺(rafoxanide)；

經取代苯酚類，例如：硝碘酚腈(nitroxynil)、硫雙二氯酚(bithionol)、二碘硝基酚(disophenol)、六氯酚(hexachlorophene)、聯硝氯酚(niclofolan)、滅硝氯酚(meniclopholan)；

有機磷酸酯類，例如：三氯松(trichlorfon)、萘伏斯(naphthalofos)、二氯松(dichlorvos)/DDVP、育畜磷(crufomate)、香豆磷(coumaphos)、哈洛克酮(haloxone)；

哌嗪酮/喹啉類，例如：吡嗪酮(praziquantel)、依西太爾(epsiprantel)；

哌嗪類，例如：哌嗪、羥基哌(hydroxyzine)；

四環素類，例如：四環素、氯四環素、去氧羥四環素(doxycycline)、氧四環素(oxytetracycline)、羅利環素(rolitetracycline)；

各種不同其他類，例如：丁萘脒(bunamidine)、硝唑咪(niridazole)、雷瑣侖太(resorantel)、臍菇亭(omphalotin)、奧替普拉(oltipraz)、硝硫氰酯(nitroscanate)、硝碘酚腈(nitroxynil)、奧沙尼喹(oxamniquine)、米拉散(mirasan)、甲硫蒽酮(miracil)、硫蒽酮(lucanthone)、羥胺硫蒽酮(hycanthone)、海妥林(hetolin)、吐根鹼(emetine)、二乙基卡馬西平(diethylcarbamazine)、二氯吩(dichlorophen)、地芬尼泰(diamfenetide)、氯硝西洋(clonazepam)、溴苄芬寧(bephenium)、硝硫氰胺(amoscanate)、氯舒隆(clorsulon)。

【0189】 抗原蟲活性化合物包括(沒有限制)下列活性化合物：

三嗪類，例如：地卡珠利(diclazuril)、泊那珠利(ponazuril)、來曲珠利(letrazuril)、托曲珠利(toltrazuril)；

聚醚離子載體(ionophores)類，例如：莫能菌素(monensin)、鹽黴素(salinomycin)、馬杜黴素(maduramicin)、甲基鹽黴素(narasin)；

大環內酯類，例如：美保黴素(milbemycin)、紅黴素(erythromycin)；

喹諾酮類，例如：恩諾沙星(enrofloxacin)、普朵沙星(pradofloxacin)；

奎寧類，例如：氯奎寧(chloroquin)；

嘧啶類，例如：嘧啶甲胺(pyrimethamine)；

磺胺類，例如：磺胺喹啉(sulfaquinoxaline)、甲氧苄啶(trimethoprim)、磺胺氯吡嗪(sulfaclozin)；

硫胺素類，例如：胺丙嘧吡啶(amprolium)；

林可醯胺類(lincosamide)，例如：克林黴素(clindamycin)；

甲醯替苯胺類，例如：雙咪苯脲(imidocarb)；

硝基呋喃類，例如：硝呋莫司(nifurtimox)；

喹唑啉酮生物鹼類，例如：鹵夫酮(halofuginone)；

各種不同其他類別，例如：奧沙尼喹(oxamniquin)、巴龍黴素(paromomycin)；

來自以下微生物之疫苗或抗原類，例如：犬焦蟲(*Babesia canis rossi*)、盲腸型球蟲(*Eimeria tenella*)、早熟艾美球蟲(*Eimeria praecox*)、毒害艾美球蟲(*Eimeria necatrix*)、和緩艾美球蟲(*Eimeria mitis*)、巨型艾美球蟲(*Eimeria maxima*)、布氏艾美球蟲(*Eimeria brunetti*)、堆型艾美球蟲(*Eimeria acervulina*)、焦蟲(*Babesia canis vogeli*)、嬰兒利什曼蟲(*Leishmania infantum*)、焦蟲(*Babesia canis canis*)、牛肺蟲(*Dictyocaulus viviparus*)。

【0190】 上述所有混合對象若其官能基可行時，亦可視需要與合適鹼類或酸類形成鹽類。

病媒防治

【0191】 式(I)化合物亦可用於防治病媒。本發明之目的中，病媒係會從帶原者(植物、動物、人類，等等)傳播病原菌(如，例如：病毒、蠕蟲、單細胞生物與細菌)給宿主之節肢動物，特定言之昆蟲或蛛形類類。該病原菌可經由機械式傳播至宿主(例如：經由非叮咬性蠅傳播之沙眼)或經由注入傳播至宿主(例如：由蚊子傳播之瘧疾寄生蟲)。

【0192】 病媒及其所傳播之疾病或病原菌之實例為：

1) 蚊類

- 按蚊(*Anopheles*)：瘧疾、絲蟲病；
- 庫蚊(*Culex*)：日本腦炎、其他病毒疾病、絲蟲病、其他蠕蟲之傳播；
- 伊蚊(*Aedes*)：黃熱病、登格熱、其他病毒疾病、絲蟲病；
- 蚋科(*Simuliidae*)：傳播蠕蟲，特定言之，盤尾線蟲(*Onchocerca volvulus*)
- 蛾蚋科(*Psychodidae*)：傳播利什曼原蟲症；

2) 蝨：皮膚傳染病、流行性斑疹傷寒；

3) 跳蚤：疫病、鼠型斑疹傷寒、條蟲；

4) 蠅：昏睡病(錐蟲病)；霍亂、其他細菌性疾病；

5) 蟎：家畜疥癬病、流行性斑疹傷寒、立克次痘疹(rickettsialpox)、兔熱病(tularamia)、聖路易腦炎(Saint-Louis encephalitis)、蜱傳播性腦炎(TBE)、克里米亞-剛果惡性血液疾病(Krim-Kongo haematologic fever)、疏螺旋體病；

6) 蜱：疏螺旋體病(borelliosis)，如：伯氏疏螺旋體(*Borrelia burgdorferi sensu lato*)、杜通氏螺旋體(*Borrelia duttoni*)、蜱傳播性腦炎、Q 熱(貝氏考克斯菌(*Coxiella burnetii*))、焦蟲症(犬焦蟲症(*Babesia canis canis*))、艾利希氏體症(ehrlichiosis)。

【0193】 本發明內容中之病媒實例為昆蟲，例如：會傳播植物病毒給植物之蚜蟲、蠅、葉蟬或薊馬。其他會傳播植物病毒之病媒為蛛形類蟎、蝨、甲蟲與線蟲。

【0194】 本發明內容中之其他病媒實例為會傳播病原菌給動物與/或人類之昆蟲與蛛形類類，如：蚊子，特定言之伊蚊(*Aedes*)、按蚊(*Anopheles*)，例如：甘比亞按蚊(*A. gambiae*)、阿拉伯按蚊(*A. arabiensis*)、致死按蚊(*A. funestus*)、大劣按蚊(*A. dirus*)(瘧疾)與庫蚊(*Culex*)、蛾蚋科(*Psychodidae*)如：白蛉(*Phlebotomus*)、羅蛉(*Lutzomyia*)、蝨、跳蚤、蠅、蟎、與蜱。

【0195】 若式(I)化合物可突破抗性時，亦可能用於防治病媒。

【0196】 式(I)化合物適用於預防由病媒傳播之疾病與/或病原菌。因此本發明另一態樣係以式(I)化合物於防治病媒之用途，例如：用於農業、園藝、花園與休閒活動設施，及亦用於保護材料與庫存產品。

保護工業材料

【0197】 式(I)化合物適用於保護工業材料，對抗昆蟲之侵害或破壞，例如：鞘翅目(Coleoptera)、膜翅目(Hymenoptera)、等翅目(Isoptera)、鱗翅目(Lepidoptera)、嚙蟲目(Psocoptera)與總尾目(Zygentoma)。

【0198】 咸了解，本文所指之工業材料為無生命材料，如：較佳為塑膠、膠黏劑、膠水、紙張與紙板、皮革、木料、加工木製品與塗料組成物。本發明用途特別適合保護木料。

【0199】 另一項實施例中，式(I)化合物係與至少一種其他殺昆蟲劑與/或至少一種殺真菌劑共同使用。

【0200】 另一項實施例中，式(I)化合物係呈現成即用型殺蟲劑，亦即其不需要進一步修飾即可施用在所需材料上。合適之其他殺昆蟲劑或殺真菌劑特定言之係彼等如上述說明者。

【0201】 亦已驚人地發現，式(I)化合物可用於保護與鹽水或鹹水接觸之物品，特定言之船體、隔板、編網、建築物、繫船設備及訊號系統，防止污塞。同樣地，式(I)化合物可單獨使用或與其他活性化合物組合，作為抗污塞劑使用。

於衛生領域中防治動物害蟲

【0202】 式(I)化合物適合在衛生領域中防治動物害蟲。特定言之，本發明可應用在居家領域、衛生領域及保護庫存產品中，尤其防治出現在如：住家、廠房、辦公室、車廂、動物養殖場等封閉空間之昆蟲、蛛形類、蜚與蟪類。式(I)化合物可單獨使用或與其他活性化合物及/或輔劑組合用於防治動物害蟲。其等較佳係家庭用殺昆蟲劑產品。式(I)化合物可有效對抗敏感性及抗性品種，並對抗所有發展階段。

【0203】 此等害蟲包括例如：蛛形類綱(Arachnida)，蠍目(Scorpiones)、蛛形類目(Araneae)與盲蛛目(Opiliones)；唇足綱(Chilopoda)與重足綱(Diplopoda)；昆蟲綱(Insecta)，蜚蠊目(Blattodea)，及鞘翅目(Coleoptera)、革翅目(Dermaptera)、

雙翅目(Diptera)、異翅目(Heteroptera)、膜翅目(Hymenoptera)、等翅目(Isoptera)、鱗翅目(Lepidoptera)、毛蟲目(Phthiraptera)、嚙蟲目(Psocoptera)、跳躍亞目(Saltatoria)或直翅目(Orthoptera)、蚤目(Siphonaptera)與總尾目(Zygentoma)，及軟甲綱(Malacostraca)，等足目(Isopoda)。

【0204】 其等可呈例如：氣溶膠、無加壓噴灑產品，例如：泵壓及霧化噴灑器、自動噴霧系統、霧化器、發泡物、凝膠、使用由纖維素或塑膠製成之蒸發片之蒸發器產品、液體蒸發器、凝膠及膜式蒸發器、螺漿驅動式蒸發器、無能源或被動式蒸發系統、防蟲紙、防蟲袋及防蟲膠，呈粒狀或塵粉，用於撒播式誘餌或用於誘餌台等形式使用。

縮寫及代號

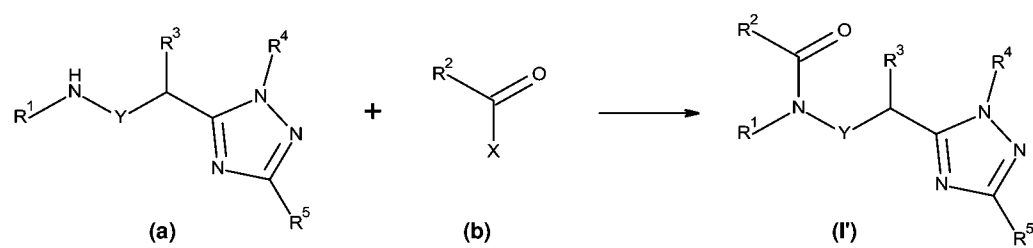
- AcOH： 乙酸
- aq.: 水性
- br.： 寬
- d： 雙峰
- DCC: N,N'-二環己基碳化二亞胺
- DIPEA： 二異丙基乙基胺
- DMF： N,N-二甲基甲醯胺
- DMSO： 二甲亞砜
- ee： 對映異構性超量
- eq.： 當量
- ES： 電噴灑電離化
- EtOAc： 乙酸乙酯
- HATU： 1-[雙(二甲基胺基)亞甲基]-1H-1,2,3-三唑并[4,5-b]吡啶鎗-3-氧化物六氟磷酸鹽
- HOBt： 1-羥基苯并三唑水合物

HPLC :	高效液相層析法
<i>i</i> PrOH :	異丙醇
<i>J</i> :	偶合常數
LCMS :	液相層析-質譜儀
<i>m/z</i> :	質量-電荷比
<i>M</i> :	莫耳濃度
<i>m</i> :	多裂峰
MeCN	乙腈
MeOH :	甲醇
NMR :	核磁共振
<i>q</i> :	四裂峰
<i>r. t.</i> :	室溫
<i>R_t</i> :	滯留時間
<i>s</i> :	單峰
<i>sat.</i> :	飽和
<i>T</i> :	溫度
<i>t</i> :	參裂峰
T3P® :	丙基膦酸酐
THF :	四氫呋喃
<i>wt.</i> :	重量
δ :	化學位移
λ :	波長

製程與中間物之說明

【0205】 式I'化合物可依下列反應途徑1所示製備，其中R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、及Y係如前述定義，及X代表OH或Cl。

反應途徑 1

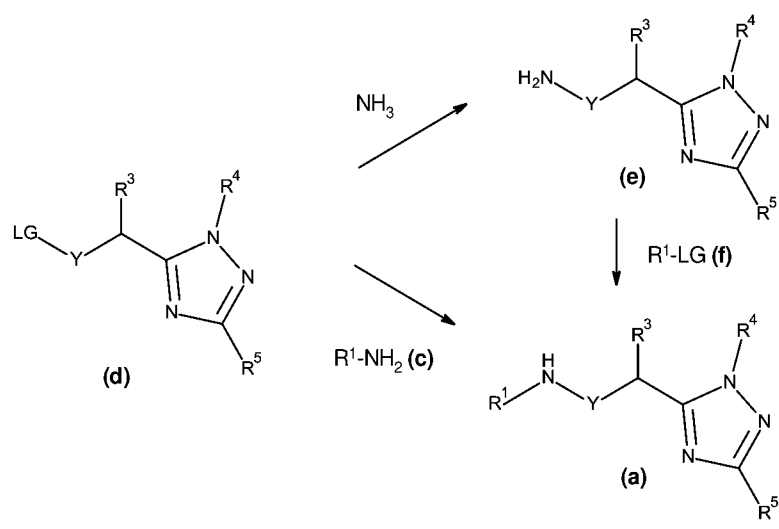


【0206】 X = OH：由式(a)三唑化合物與式(b)羧酸(X = OH)反應，形成式I' 化合物。例如：由式(a)三唑、式(b)羧酸 (X = OH)、合適之偶合試劑(如：T3P[®]、HATU、DCC或HOBt)、合適之鹼(如：三乙基胺或DIPEA)之混合物，於合適之溶劑(如：乙酸乙酯或DMF)中，於約0至100°C之溫度範圍下混合，產生式I' 化合物，其可隨後單離，及若必要及需要時，可採用相關技藝習知之技術(如：層析法)純化。

【0207】 X = Cl：由式(a)三唑化合物與式(b)醯基氯(X = Cl)反應，形成式I' 化合物。例如：由式(a)三唑、式(b)醯基氯(X = Cl)、合適之鹼(如：三乙基胺或DIPEA)之混合物，於合適之溶劑(如：二氯甲烷或THF)中，於約0至100°C之溫度範圍下混合，產生式I' 化合物，其可隨後單離，及若必要及需要時，可採用相關技藝習知之技術(如：層析法)純化。

【0208】 式(b)羧酸(X = OH)及式(b)醯基氯(X = Cl)可自商品取得或可採用習此相關技藝者已知之方法合成。所需之式(a)三唑化合物可依下列反應途徑2之說明製備，其中R¹、R³、R⁴、R⁵及Y係如前述說明，及LG為合適之脫離基(亦參見WO 2017192385及WO 2019/170626 A1)。

反應途徑 2

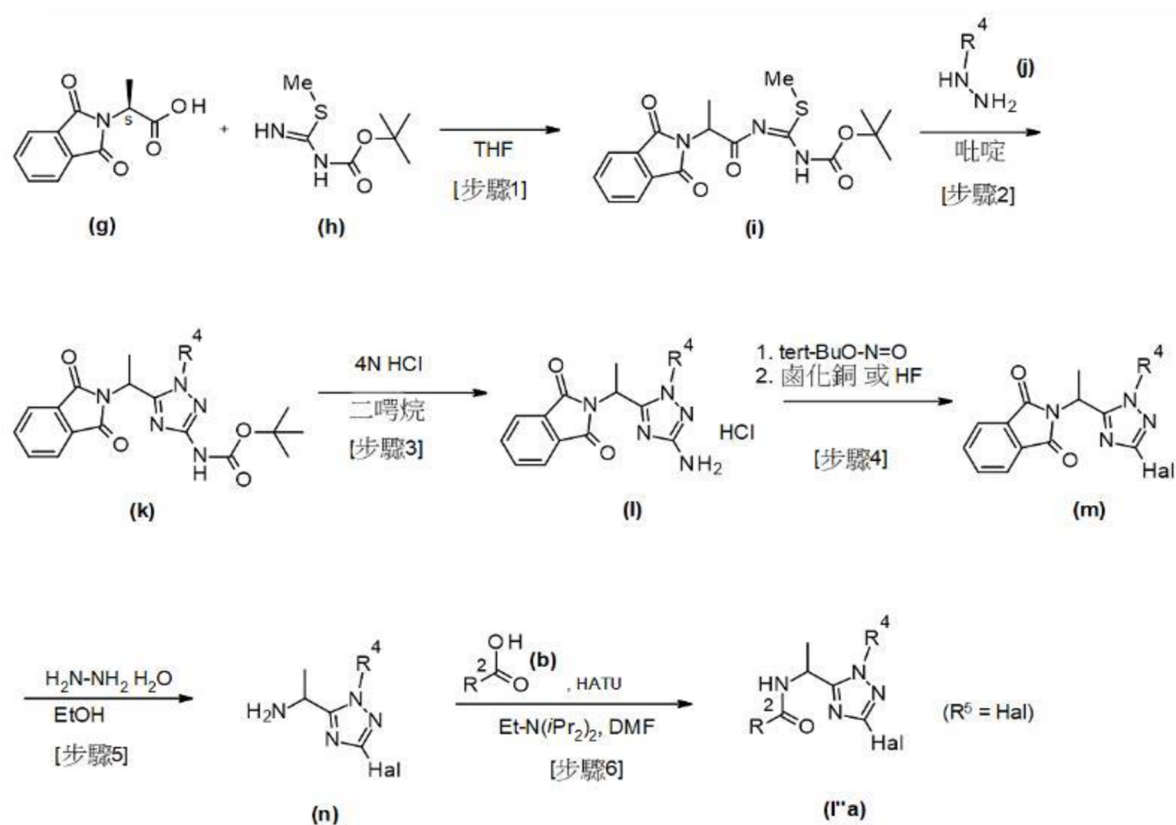


【0209】 由式(c)胺與式(d)經取代之三唑反應，形成式(a)化合物。例如：由式(d)三唑、式(c)胺、合適之鹼(如： K_2CO_3 、NaH或DIPEA)，於合適之溶劑(如：乙腈或DMF)中，於約20至120°C之溫度範圍下混合，產生式(a)化合物，其可隨後單離，及若必要及需要時，可採用相關技藝習知之技術(如：層析法)純化。

【0210】 或者，由式(d)經取代之三唑與氨反應，形成式(e)化合物。例如：由氨含於合適溶劑(如：甲醇)中之溶液與式(d)經取代之三唑於密封管中，於約0至25°C之溫度範圍下混合，產生式(e)化合物，其可隨後單離，及若必要及需要時，採用相關技藝習知之技術(如：研磨法)純化。由式(e)經取代之三唑、式(f)化合物、合適之鹼(如： K_2CO_3 或DIPEA)，於合適之溶劑(如：乙腈或DMF)中，於約20至120°C之溫度範圍下混合，產生式(a)化合物，其可隨後單離，及若必要及需要時，可採用相關技藝習知之技術(如：層析法)純化。

【0211】 反應途徑3說明包含3-鹵素三唑之胺(n)之製法，其係用於合成例如：實例I-001。 R^1 為氫， R^3 為甲基，X為氧；Y為直接鍵結， R^5 為鹵素，如：氟、氯、溴或碘，及 R^2 與 R^4 係如式(I)中指示之定義。

反應途徑 3

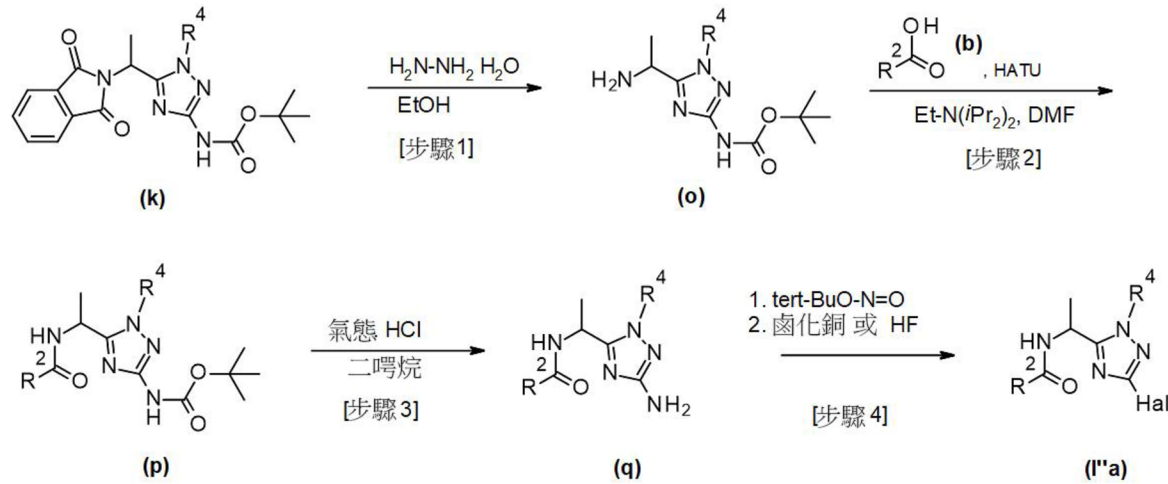


【0212】 第一個步驟中，由(αS)-1,3-二氫-α-甲基-1,3-二側氧基-2H-異吡啶-2-乙酸(g) (Pht-Ala-OH，購自ABCR)與1-N-Boc-2-甲基-異硫脲(h) (購自ABCR)，於鹼及偶合試劑 HATU之存在下反應，形成N-醯基化1-N-Boc-2-甲基-異硫脲(i)。第二個步驟中，與R⁴-取代之肼(j)在鹼(如：吡啶)之存在下進行環化(如WO 2014009425 A1中之說明)，形成式(k)1,2,4-三唑，其中R⁵為NH-Boc基。在第三個步驟中，於酸性條件下(例如：含HCl之二噁烷)脫除N-Boc保護基，形成3-胺基-1,2,4-三唑鹽酸鹽(l) (R⁵ = NH₂)，其可於第四個步驟中，先經過亞硝酸第三丁酯處理，然後使用呈鹽型之鹵化銅處理，如：CuCl₂ (R⁵ = Cl)，其說明於N. Desroy 等人之*J. Med. Chem.* 2013, 56, 1418-1430；CuBr₂ (R⁵ = Br)，其說明於JP-Pat. 2010070503 A；CuI/I₂ 混合物(R⁵ = I)，其說明於K. Pchalek及M. P. Hay *J. Org. Chem.* 2006, 71, 6530-6535；或使用二碘甲烷(R⁵ = I)，其說明於N. R. Norcross等人之*J. Med. Chem.*, 2016, 59(13), 6101-6120，形成3-鹵素取代之1,2,4-三唑(m)。或者，可以例如：改用HF替代鹵化銅，引入氟(R⁵ = F)，其說明於V. Krchnak及Z. Arnold 之*Coll. Czech. Chem. Commun.*, 1975, 40(5), 1390-1395。第五個步驟中，與肼水合

物於合適之溶劑(如：乙醇)中反應，脫除(m)中之酞醯亞胺保護基，其說明於WO 2018086605。最後一個步驟中，由所得之胺(n)與羧酸(b)反應，形成如：實例I-001之實例化合物，例如：(I''a)，其係如反應途徑1之說明。

【0213】 反應途徑4說明3-胺基取代之1,2,4-三唑(q)之製法，其係用為合成例如：實例I-017至I-019之起始化合物。 R^1 為氫， R^3 為甲基，X為氧，Y為直接鍵結，及 R^5 為鹵，(如：氟、氯、溴或碘)，及 R^2 與 R^4 具有式(I)中指示之定義。

反應途徑 4

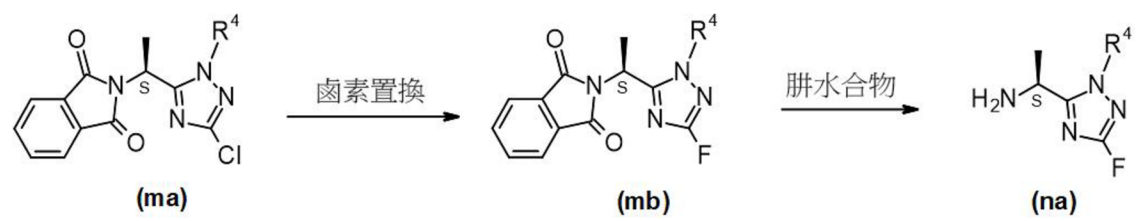


【0214】 第一個步驟中，由式(k)1,2,4-三唑(其中 R^5 為NH-Boc基)(參見反應途徑3)與肼水合物，於合適之溶劑(如：乙醇)中反應，脫除酞醯亞胺保護基，其說明於WO 2018086605。然後在第二個步驟中，由所得之N-Boc-保護之胺(o)與羧酸(b)反應，形成化合物(p)。在第三個步驟中，於酸性條件下(例如：含HCl之二噁烷)脫除N-Boc保護基後，形成3-胺基-1,2,4-三唑(q) ($R^5 = NH_2$)，其可於最後的第四步驟中，先經過亞硝酸第三丁酯處理，然後使用呈鹽型之鹵化銅處理，如： $CuCl_2$ ($R^5 = Cl$)，其說明於N. Desroy等人之*J. Med. Chem.* 2013, 56, 1418-1430； $CuBr_2$ ($R^5 = Br$)，其說明於JP-Pat. 2010070503 A； CuI/I_2 混合物($R^5 = I$)，其說明於K. Pchalek及M. P. Hay *J. Org. Chem.* 2006, 71, 6530-6535；或使用二碘甲烷($R^5 = I$)，其說明於N. R. Norcross等人之*J. Med. Chem.*, 2016, 59(13), 6101-6120，形成3-鹵素取代之1,2,4-三唑(I''a)，例如：實例I-017至I-019。

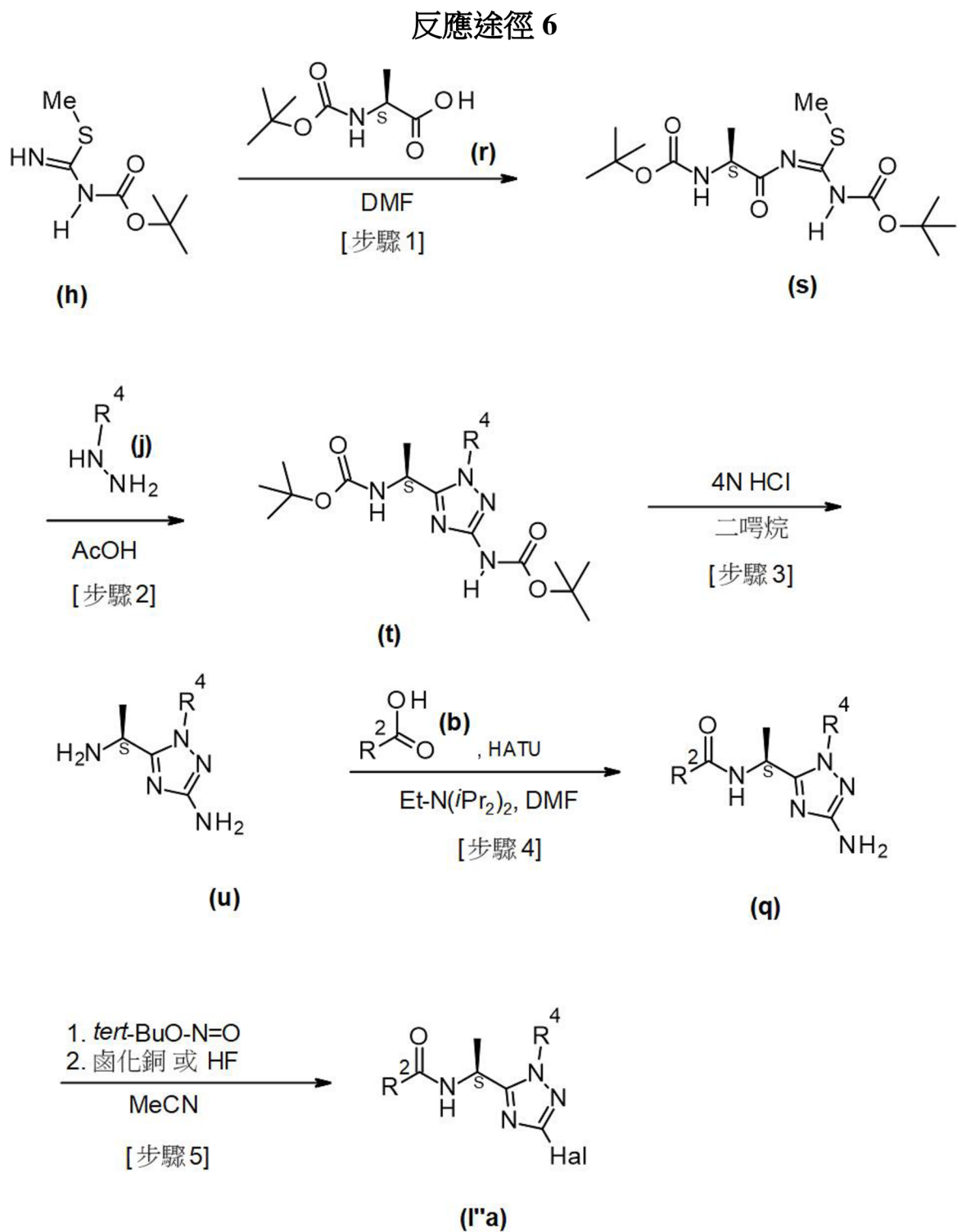
【0215】 可以改用HF替代鹵化銅，引入氟 ($R^5 = F$)，其說明於例如：V. Krchnak 及Z. Arnold *Coll. Czech. Chem. Commun.*, 1975, 40(5), 1390-1395 (參見反應途徑 4)，其係由3-重氮-3*H*-[1,2,4]三唑於濃縮之四氟硼酸中進行光反應(EP1208321, 1987)或如A. Zumbrunn *Synthesis* 1357-1361, 1998之說明，改用溴化物，於二甲亞 碸中，於120°C下反應。

【0216】 此外，於受到酞醯基保護之中間物(ma)中，以氟置換氯 ($R^5 = Cl$)，可能產生氟化中間物(mb)，脫除保護基，即可得到對應之3-氟取代之1,2,4-三唑 胺(na)。

反應途徑 5



【0217】 反應途徑6說明富集(*S*)-對映異構性之3-胺基取代之1,2,4-三唑(q)，其係用為合成例如：實例I-027之起始化合物。 R^1 為氫， R^3 為甲基，X為氧，Y為直接鍵結及 R^5 為鹵素(如：氟、氯、溴或碘)，及 R^2 與 R^4 具有式(I)中指示之定義。



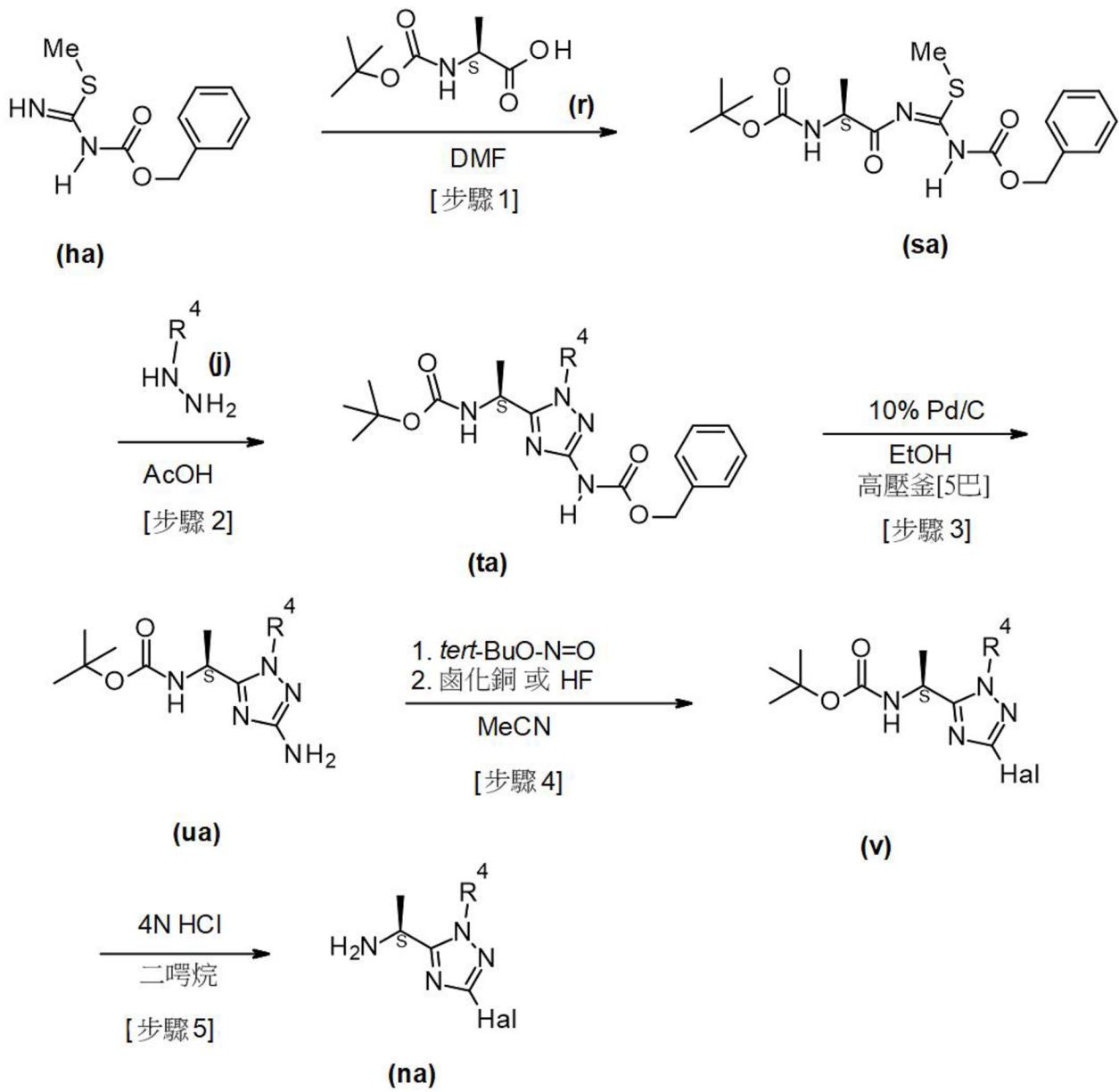
【0218】 第一個步驟中，由*N*-Boc-丙胺酸(r)與1-*N*-Boc-2-甲基-異硫脲(h) (購自 ABCR) (參見反應途徑5)，於鹼及偶合試劑(如：HATU)之存在下反應，形成*N*-[(1*S*)-2-[[第三丁氧基羰基胺基)-甲基氫硫基-亞甲基]胺基]-1-甲基-2-側氧基-乙基]胺甲酸第三丁酯(s)，其未純化即使用。於第二個步驟中，由(s)與R⁴-取代之肼(j)，在酸(如：乙酸)之存在下進行環化，形成富集(*S*)-對映異構性之受NH-Boc

保護之式(t)1,2,4-三唑，其中 R^5 為NH-Boc。第三個步驟中，與4N HCl之二噁烷溶液反應，脫除式(t) 1,2,4-三唑中兩個 *N*-Boc保護基，其中 R^5 為NH-Boc，形成包含3-胺基-1,2,4-三唑之胺(u)或相關之鹽酸鹽。然後，於第四個步驟中，由所得式(u)1,2,4-三唑胺與羧酸(b)反應，形成化合物(q)。在最後的第五步驟中，先由化合物(q)與亞硝酸第三丁酯反應，然後與呈鹽型之鹵化銅反應，如： $CuCl_2$ ($R^5 = Cl$)，其說明於N. Desroy等人之*J. Med. Chem.* 2013, 56, 1418-1430； $CuBr_2$ ($R^5 = Br$)，其說明於JP-Pat. 2010070503 A；或與二碘甲烷($R^5 = I$)反應，其說明於N. R. Norcross等人之*J. Med. Chem.*, 2016, 59(13), 6101-6120，形成富集(*S*)-對映異構性之3-鹵素取代之1,2,4-三唑(I'a)，如：實例化合物I-027所示。

【0219】 1-*N*-Boc-2-甲基-異硫脲可自商品取得：參見ABCR GmbH Product List 產品列表：AB528361。

【0220】 反應途徑7說明富集(*S*)-對映異構性之含3-鹵素三唑之胺中間物(na)之製法，其中 R^1 為氫， R^3 為甲基，Y為直接鍵結，及 R^5 為鹵素(如：氟、氯、溴或碘)，及 R^4 具有式(I)中指示之定義。

反應途徑 7



【0221】 第一個步驟中，由N-Boc-丙胺酸(r)與1-*N*-Z-2-甲基-異硫脲(ha)(購自 Chemieliva Pharmaceutical Product List產品列表) (參見反應途徑6)，於鹼及偶合試劑(如：HATU)之存在下反應，形成*N*-[(1*S*)-2-[(苯甲基氧羰基胺基)-甲基氫硫基-亞甲基]胺基]-1-甲基-2-側氧基-乙基]胺甲酸第三丁酯(sa)，其未純化即可使用。在第二個步驟中，由(sa)與R⁴-取代之肼(j)在酸(如：乙酸)之存在下環化，形成富集(*S*)-對映異構性之式(ta)NH-Z、NH-Boc保護之1,2,4-三唑，其中R⁵為NH-Z。第三個步驟中，由式(ta)1,2,4-三唑(其中R⁵為NH-Z)，於10%鈀/碳之存在下進行氫化(高壓釜，5巴)，脫除*N*-Z保護基，形成NH-Boc保護之3-胺基-1,2,4-三唑 (ua)。

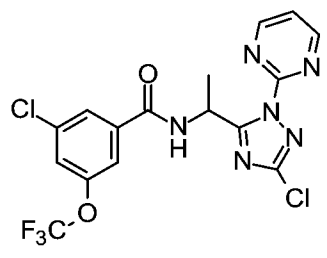
然後在第四個步驟中，先由所得式(ua)NH-Boc保護之3-胺基-1,2,4-三唑與亞硝酸第三丁酯反應，然後與呈鹽型之鹵化銅反應(如： CuCl_2 ($\text{R}^5 = \text{Cl}$))，其說明於N. Desroy等人之*J. Med. Chem.* 2013, 56, 1418-1430； CuBr_2 ($\text{R}^5 = \text{Br}$)，其說明於JP-Pat. 2010070503 A；或與二碘甲烷($\text{R}^5 = \text{I}$)反應，其說明於N. R. Norcross等人之*J. Med. Chem.*, 2016, 59(13), 6101-6120，形成富集(S)-對映異構性之NH-Boc-保護之3-鹵素取代之1,2,4-三唑中間物(v)。在最後的第五步驟中，由中間物(v)使用4N HCl之二噁烷溶液處理，形成包含3-鹵素-1,2,4-三唑之胺(na)，其可與羧酸(b)偶合，形成富集(S)-對映異構性之化合物(I''a)。

【0222】 1-N-Z-2-甲基-異硫脲可自商品取得：參見(Chemieliva Pharmaceutical Product List產品列表；訂購編號：CA1251032)；Z = 苯甲基氧羰基。

【0223】 下列製備及應用實例係說明本發明，沒有加以限制。

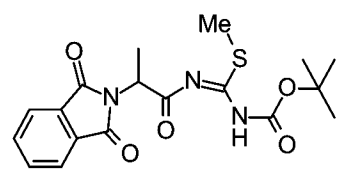
製備實例

【0224】 3-氯-N-[1-(5-氯-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]-5-(三氟甲氧基)苯甲醯胺之合成法(實例I-001)



步驟 1

N-[N-[2-(1,3-二側氧基異吡啶啉-2-基)丙醯基]-C-甲基氫硫基-亞胺羰基]胺甲酸第三丁酯



【0225】 在含1.09 g (5.0 mmol) (α S)-1,3-二氫- α -甲基-1,3-二側氧基-2*H*-異吡啶-2-乙酸(Ph_t-Ala-OH，購自ABCR)及0.95 g (5.0 mmol) 1-*N*-Boc-2-甲基-異硫脲(購自ABCR)之THF (30 ml)中，添加三乙基胺(2.1 ml)及HATU，反應混合物於80°C溫度下攪拌，及再於相同溫度下攪拌2 h。然後加水，混合物使用碳酸氫鈉溶液及二氯甲烷萃取。脫水後，蒸發溶劑。殘留之固體殘質於矽膠上，使用環乙烷/丙酮梯度層析，產生1.40 g (純度：97.0 %；產率：70 %)消旋性標題化合物。

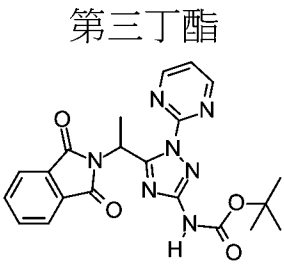
分子式： $\text{C}_{18}\text{H}_{21}\text{N}_3\text{O}_5\text{S}$ 分子量：391.44 g/mol

UPLC-MS (酸) [m/z]: 392.2 [M+H]⁺

¹H-NMR 波峰列表 (400 MHz, DMSO-d₆, ppm): δ = 11.8958 (0.5); 11.4353 (0.9); 7.9299 (0.5); 7.9221 (1.0); 7.9152 (1.2); 7.9102 (1.0); 7.9063 (1.2); 7.9000 (2.1); 7.8930 (1.1); 7.8847 (2.6); 7.8785 (1.3); 7.8744 (1.2); 7.8627 (0.8); 4.9976 (0.8); 4.9794 (0.8); 3.3230 (9.5); 2.5251 (0.4); 2.5204 (0.6); 2.5117 (8.2); 2.5072 (16.6); 2.5027 (21.9); 2.4981 (15.8); 2.4936 (7.6); 2.2949 (2.4); 1.9720 (6.0); 1.6029 (2.9); 1.5848 (3.0); 1.5719 (1.3); 1.5540 (1.1); 1.4430 (16.0); 1.3971 (11.0); 1.2665 (6.6); -0.0002 (0.5).

步驟 2

N-[5-[1-(1,3-二側氧基異吡啶啉-2-基)乙基]-1-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基]胺甲酸



【0226】 在含1.0 g (2.55 mmol) *N*-[*N*-[2-(1,3-二側氧基異呋啉-2-基)丙醯基]-*C*-甲基氫硫基-亞胺羰基]胺甲酸第三丁酯之吡啶 (50 ml) 溶液中，添加337.5 mg (3.06 mmol) 2-胍基嘧啶，於室溫下攪拌反應混合物2h於80 °C溫度下。之後，真空蒸發溶劑，粗產物於矽膠上，使用環乙烷/丙酮梯度層析，產生780 mg (純度：95.9 %；產率：67 %)消旋性標題化合物。

分子式： $\text{C}_{21}\text{H}_{21}\text{N}_7\text{O}_4$

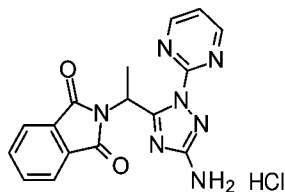
分子量：435.43 g/mol

UPLC-MS (酸) [m/z]: 436.3 [M+H]⁺

¹H-NMR 波峰列表 (600 MHz, DMSO-d₆, ppm): δ = 9.9739 (1.2); 8.7635 (2.7); 8.7554 (2.7); 7.8169 (0.6); 7.8126 (0.8); 7.8097 (2.9); 7.8052 (3.0); 7.8020 (0.9); 7.7979 (0.6); 7.4395 (0.7); 7.4315 (1.4); 7.4234 (0.7); 6.0850 (0.8); 6.0732 (0.8); 5.7533 (0.3); 3.3088 (9.2); 2.5080 (3.8); 2.5050 (8.0); 2.5020 (11.1); 2.4989 (8.1); 2.4960 (3.8); 1.9448 (0.4); 1.9123 (0.4); 1.8008 (2.4); 1.7890 (2.4); 1.4365 (16.0); 1.3974 (6.1); -0.0001 (1.9).

步驟 3

2-[1-(5-氨基-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]異弓噪啉-1,3-二酮鹽酸鹽



【0227】 取8.8 g (17.1 mmol) *N*-[5-[1-(1,3-二側氧基異呋]噻啉-2-基)乙基]-1-噻啉-2-基-1,2,4-三唑-3-基]胺甲酸第三丁酯，使用4N HCl之二噁烷溶液 (150 ml)處理，及於室溫下攪拌反應混合物18 h。然後濃縮反應混合物，消旋性固體殘質未純化即用於引進鹵素之反應(步驟4)。

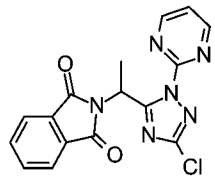
分子式： $C_{16}H_{14}ClN_7O_2$

分子量：371.78 g/mol

HPLC-MS (ESI 正電荷) [m/z]: 336.2 [M-HCl]⁺

步驟 4

2-[1-(5-氯-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]異吲哚啉-1,3-二酮



【0228】 在含300.0 mg (0.89 mmol) 2-[1-(5-胺基-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]異吲哚啉-1,3-二酮-鹽酸鹽之乙腈(20 ml)中，添加204.5 mg (1.52 mmol) Cu(II)-氯化物，然後於室溫下，滴加129.1 mg (1.25 mmol) 亞硝酸第三丁酯處理反應混合物。反應混合物於70°C溫度下攪拌1 h。反應混合物使用乙酸乙酯處理，接著使用飽和NaHCO₃溶液及水萃取。分離有機相，脫水及蒸發溶劑，產生178 mg (純度：77 %；產率：56 %)消旋性標題化合物，其未純化即用於偶合反應(步驟5)。

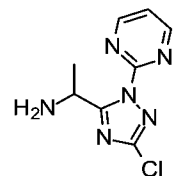
分子式： $C_{16}H_{11}ClN_6O_2$

分子量：354.75 g/mol

UPLC-MS (酸) [m/z]: 355.3 [M+H]⁺

步驟 5

1-(5-氯-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺 (INT-01)



【0229】 在含499.0 mg (2.5 mmol) 2-[1-(5-氯-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]異吲哚啉-1,3-二酮之乙醇(20 mL)中，添加320.0 mg (3.51 mmol) 胼-水合物，反應混合物於回流下加熱。30分鐘後，有無色沉澱形成。攪拌反應混合物，再於回流下加熱2小時，添加丙酮 (2 mL)，再繼續加熱30分鐘。反應混合物濃縮，固體殘質使用乙醇處理。過濾後，濾液減壓蒸發，產生310.0 mg (純度：70-80 %，產率：98 %)消旋性中間物INT-01，其未純化即用於步驟6。

分子式：C₈H₉ClN₆

分子量：224.65 g/mol

UPLC-MS (中性) [m/z]: 225.1 [M+H]⁺

步驟 6

3-氯-N-[1-(5-氯-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]-5-(三氟甲氧基)苯甲醯胺

【0230】 在含150.0 mg (0.66 mmol) 1-(5-氯-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺、164.0 mg (0.66 mmol) 3-氯-5-(三氟甲氧基)-苯甲酸、120 mg (0.92 mmol) DIPEA之DMF (3 mL)中，添加310.0 mg (0.81 mmol) HATU，反應混合物於室溫下攪拌一夜。反應混合物減壓濃縮，固體殘質使用二氯甲烷處理，接著使用飽和NaHCO₃水溶液及水萃取。分離有機相，經Na₂SO₄脫水，及減壓蒸發溶劑。殘留之固體殘質經HPLC，使用水/乙腈中性梯度純化，得到122.0 mg (純度：98.8 %；產率：41 %)消旋性標題化合物。

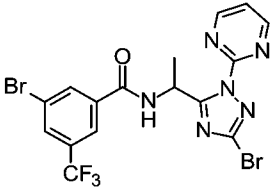
分子式：C₁₈H₁₁BrN₆O₂

分子量：447.20 g/mol

HPLC-MS 中性 (ESI 正電荷) [m/z]: 447.1 [M+H]⁺

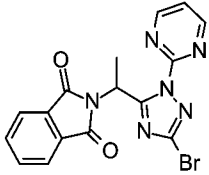
【0231】 下表1所列之式 (I-002) – (I-008)化合物可依類似方法製備。

【0232】 3-溴-N-[1-(5-溴-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]-5-(三氟甲基)苯甲醯胺之合成法(實例I-009)



步驟 1

2-[1-(5-溴-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]異吲哚啉-1,3-二酮



【0233】 在300.0 mg (0.89 mmol) 2-[1-(5-胺基-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]異吲哚啉-1,3-二酮-鹽酸鹽之乙腈(20 ml) (依據實例I-001步驟1-3合成) 中，添加350.0 mg (1.56 mmol) 溴化銅(II)，隨後於室溫下滴加150 mg (1.45 mmol) 亞硝酸第三丁酯處理反應混合物。反應混合物於70°C溫度下攪拌1 h。反應混合物使用乙酸乙酯處理，接著使用飽和NaHCO₃溶液及水萃取。分離有機相，經Na₂SO₄脫水，及減壓蒸發溶劑。殘留之固體殘質經HPLC，使用水/MeCN 中性梯度純化，得到234.0 mg (純度：96.8 %；產率：66 %)消旋性標題化合物。

分子式：C₁₆H₁₁BrN₆O₂

分子量：398.01 g/mol

HPLC-MS (ESI 正電荷) [m/z]: 399.2 [M+H]⁺

步驟 2

1-(5-溴-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺 (INT-02)



【0234】 在1.16 g (2.9 mmol) 2-[1-(5-溴-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]異吲哚啉-1,3-二酮2之乙醇(30 mL)中，添加678.8 mg (7.45 mmol) 肼-水合物，反應混合物於回流下加熱。30分鐘後，有無色沉澱形成。攪拌反應混合物，及再於回流下加熱2小時，添加丙酮 (20 mL)，再繼續加熱30分鐘。反應混合物濃縮，及使用乙醇處理固體殘質。過濾後，濾液減壓蒸發，產生900 mg (純度：50-60%) 消旋性中間物INT-02，其未純化即用於步驟6。

分子式： $C_8H_9BrN_6$

分子量：269.11 g/mol

UPLC-MS (中性): 271.1 $[M+H]^+$

步驟 3

3-溴-N-[1-(5-溴-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]-5-(三氟甲基)苯甲醯胺

【0235】 在含122.6 mg (0.45 mmol) 1-(5-溴-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺、125.0 mg (0.45 mmol) 3-溴-5-(三氟甲基)-苯甲酸(純度：97%)、81.7 mg (0.63 mmol) DIPEA之3.76 g (51.5 mmol) DMF中，添加205.6 mg (0.54 mmol) HATU，反應混合物於室溫下攪拌一夜。反應混合物減壓濃縮，固體殘質使用二氯甲烷處理，接著使用飽和 $NaHCO_3$ 水溶液及水萃取。分離有機相，經 Na_2SO_4 脫水，及減壓蒸發溶劑。殘留之固體殘質經HPLC，使用水/MeCN 中性梯度純化，得到29.0 mg (純度：100 %；產率：12 %)消旋性標題化合物。

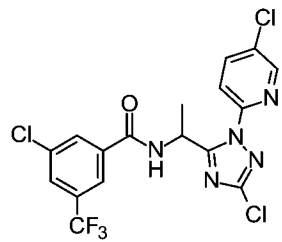
分子式： $C_{16}H_{11}Br_2F_3N_6O$

分子量：520.11 g/mol

HPLC-MS 酸(ESI 正電荷) $[m/z]$: 521.0 $[M+H]^+$

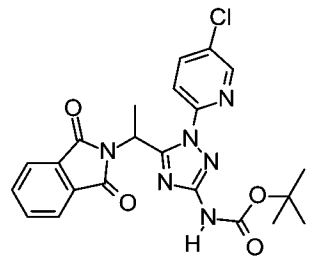
【0236】 下表1所列式(I-010) – (I-016)化合物可依類似方法製備。

【0237】 3-氯-N-[1-[5-氯-2-(5-氯-2-吡啶基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]-5-(三氟甲基)苯甲醯胺之合成法(實例I-017)



步驟 1

N-[1-(5-氯-2-吡啶基)-5-[1-(1,3-二側氧基異吡啶啉-2-基)乙基]-1,2,4-三唑-3-基]胺
甲酸第三丁酯



【0238】 在含16.4 g (41.9 mmol) N-[N-[2-(1,3-二側氧基異吡啶啉-2-基)丙醯基]-C-甲基氫硫基-亞胺羰基]胺甲酸第三丁酯(依據實例I-001步驟1合成)之吡啶(200 ml)溶液中，添加7.2 g (50.3 mmol) 5-氯-2-胍基-吡啶，反應混合物於80 °C溫度下攪拌2.5 h。之後，真空蒸發溶劑，粗產物於矽膠上，使用環乙烷/丙酮梯度層析，產生17.9 g (純度：99.1 %；產率：90.6 %)消旋性標題化合物。

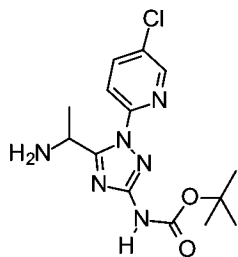
分子式：C₂₂H₂₁ClN₆O₄

分子量：468.90 g/mol

HPLC-MS (ESI 正電荷) [m/z]: 269.1 (M+H)⁺

步驟 2

N-[5-(1-胺基乙基)-1-(5-氯-2-吡啶基)-1,2,4-三唑-3-基]胺甲酸第三丁酯



【0239】 在含15.0 g (31.9 mmol) *N*-[1-(5-氯-2-吡啶基)-5-[1-(1,3-二側氧基異呔啉-2-基)乙基]-1,2,4-三唑-3-基]胺甲酸第三丁酯之乙醇(300 mL)中，添加7.2 g (79.9 mmol) 肼-水合物，反應混合物於回流下加熱。30分鐘後，有無色沉澱形成。攪拌反應混合物，及再於回流下加熱2小時，添加丙酮，再繼續加熱30分鐘。反應混合物濃縮，及使用乙醇處理固體殘質。過濾後，濾液減壓蒸發，產生10.8 g (產率：100 %)消旋性標題化合物，其未純化即用於步驟3。

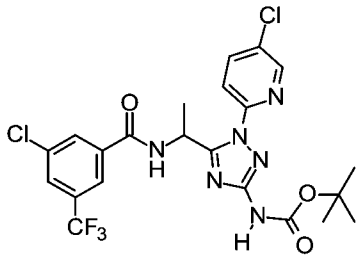
分子式： $C_{14}H_{19}ClN_6O_2$

分子量：338.80 g/mol

HPLC-MS 酸(ESI 正電荷) [m/z]: 339.1 [M+H]⁺

步驟 3

N-[1-(5-氯-2-吡啶基)-5-[1-[[3-氯-5-(三氟甲基)苯甲醯基]胺基]乙基]-1,2,4-三唑-3-基]胺甲酸第三丁酯



【0240】 在含9.4 g (27.8 mmol) *N*-[5-(1-胺基乙基)-1-(5-氯-2-吡啶基)-1,2,4-三唑-3-基]胺甲酸第三丁酯、6.4 g (27.8 mmol) 3-氯-5-(三氟甲基)-苯甲酸(純度：97%)、4.6 g (36.2 mmol) DIPEA之DMF (300 mL)中，添加12.7 g (33.4 mmol) HATU，反應混合物於室溫下攪拌一夜。反應混合物減壓濃縮，固體殘質使用二氯甲烷處理，接著使用飽和NaHCO₃水溶液及水萃取。分離有機相，經Na₂SO₄

脫水，及減壓蒸發溶劑。殘留之固體殘質先經MPLC，使用環乙烷/丙酮梯度純化(純度：50.1 %)，之後再經HPLC，使用水/MeCN 中性梯度純化，得到4.3 g (純度：100 %；產率：29 %)消旋性標題化合物。

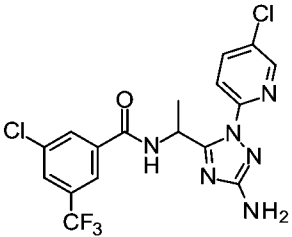
分子式： $C_{22}H_{21}Cl_2F_3N_6O_3$

分子量：545.35 g/mol

HPLC-MS 酸(ESI 正電荷) [m/z]: 545.3 [M+H]⁺

步驟 4

N-[1-[5-胺基-2-(5-氯-2-吡啶基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]-3-氯-5-(三氟甲基)苯甲醯胺



【0241】 取4.2 g (7.8 mmol) *N*-[1-(5-氯-2-吡啶基)-5-[1-[[3-氯-5-(三氟甲基)苯甲醯基]胺基]乙基]-1,2,4-三唑-3-基]胺甲酸第三丁酯，使用4N HCl之二噁烷溶液(403 ml)處理，於室溫下攪拌反應混合物18 h。然後濃縮反應混合物，消旋性固體殘質未純化即用於引進鹵素之反應(步驟5)。

分子式： $C_{17}H_{13}Cl_2F_3N_6O$

分子量：445.23 g/mol

HPLC-MS 酸(ESI 正電荷) [m/z]: 446.1 [M+H]⁺

步驟 5

3-氯-*N*-[1-[5-氯-2-(5-氯-2-吡啶基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]-5-(三氟甲基)苯甲醯胺

【0242】 在含300.0 mg (0.67 mmol) *N*-[1-[5-胺基-2-(5-氯-2-吡啶基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]-3-氯-5-(三氟甲基)苯甲醯胺之乙腈(15 mL)中，添加154.0 mg (1.14 mmol)氯化銅(II)，然後於室溫下，滴加97.2 mg (0.94 mmol) 亞硝酸第三丁酯處理反應混合物。然後於70°C溫度下攪拌反應混合物1 h。反應混合物使用乙酸乙酯處理，接著使用飽和NaCl溶液萃取。之後，真空蒸發溶劑，粗產物於矽膠上，使用環乙烷/丙酮梯度層析，產生78.8 mg g (純度：100 %；產率：25 %)消旋性標題化合物。

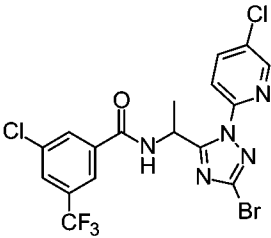
分子式：C₁₇H₁₁Cl₃F₃N₅O

分子量：464.66 g/mol

HPLC-MS 酸(ESI 正電荷) [m/z]: 465.1 [M+H]⁺

¹H-NMR 波峰列表 (600 MHz, DMSO-d₆, ppm): δ = 9.4153 (2.5); 9.4039 (2.5); 8.6405 (4.4); 8.6397 (4.4); 8.6363 (4.6); 8.6354 (4.4); 8.2234 (3.8); 8.2191 (3.7); 8.2089 (4.1); 8.2045 (4.1); 8.1234 (4.3); 8.1208 (2.9); 8.0758 (3.9); 8.0629 (4.2); 7.8635 (5.1); 7.8627 (5.0); 7.8490 (4.7); 7.8482 (4.6); 5.9368 (0.4); 5.9252 (2.1); 5.9137 (3.3); 5.9022 (2.2); 5.8906 (0.4); 3.3194 (43.3); 2.6183 (0.3); 2.6152 (0.5); 2.6122 (0.3); 2.5243 (1.0); 2.5212 (1.2); 2.5180 (1.2); 2.5093 (25.1); 2.5062 (54.5); 2.5031 (77.0); 2.5001 (56.8); 2.4971 (26.3); 2.3902 (0.3); 2.3871 (0.5); 2.3840 (0.3); 1.6404 (11.4); 1.6287 (11.5); 1.3975 (16.0); -0.0001 (4.0).

【0243】 *N*-[1-[5-溴-2-(5-氯-2-吡啶基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]-3-氯-5-(三氟甲基)苯甲醯胺之合成法(實例I-018)



【0244】 在含200.0 mg (0.44 mmol) *N*-[1-[5-胺基-2-(5-氯-2-吡啶基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]-3-氯-5-(三氟甲基)苯甲醯胺(依據實例I-017步驟4合成)之MeCN (10 mL)中，添加170.5 mg (0.76 mmol)溴化銅(II)，然後於室溫下，使用64.8 mg (0.62 mmol) 亞硝酸第三丁酯處理反應混合物。然後於70 °C溫度下攪拌反應混合物1 h。反應混合物使用乙酸乙酯處理，接著使用飽和NaCl溶液萃取。之後，真空蒸發溶劑，粗產物於矽膠上，使用環乙烷/丙酮梯度層析，產生93.8 mg (純度：99.3 %；產率：41 %)消旋性標題化合物。

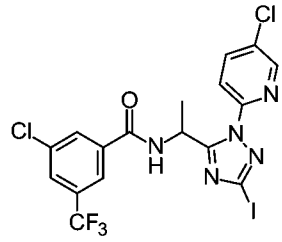
分子式：C₁₇H₁₁BrCl₂F₃N₅O

分子量：509.12 g/mol

HPLC-MS 酸(ESI 正電荷) [m/z]: 510.0 [M+H]⁺

¹H-NMR 波峰列表 (600 MHz, DMSO-d₆, ppm): δ = 9.4115 (2.6); 9.4001 (2.7); 8.6396 (0.4); 8.6349 (4.7); 8.6311 (4.5); 8.6307 (4.4); 8.2163 (3.4); 8.2120 (3.3); 8.2089 (0.4); 8.2018 (3.6); 8.1975 (3.6); 8.1214 (4.6); 8.0745 (4.3); 8.0615 (4.7); 7.8651 (5.0); 7.8506 (4.6); 5.9417 (0.4); 5.9302 (2.0); 5.9253 (0.4); 5.9186 (3.2); 5.9139 (0.5); 5.9071 (2.1); 5.8955 (0.4); 3.3216 (92.2); 2.6184 (0.4); 2.6154 (0.5); 2.6124 (0.4); 2.5244 (1.1); 2.5214 (1.4); 2.5182 (1.5); 2.5094 (26.3); 2.5064 (55.2); 2.5033 (76.9); 2.5003 (57.3); 2.4973 (27.2); 2.3904 (0.4); 2.3873 (0.5); 2.3843 (0.3); 1.6353 (11.1); 1.6285 (2.0); 1.6237 (11.1); 1.3974 (16.0); -0.0001 (2.7).

【0245】 3-氯-*N*-[1-[2-(5-氯-2-吡啶基)-5-碘-1,2,4-三唑-3-基]乙基]-5-(三氟甲基)苯甲醯胺之合成法(實例I-019)



方法 A：

【0246】 在含300.0 mg (0.67 mmol) *N*-[1-[5-胺基-2-(5-氯-2-吡啶基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]-3-氯-5-(三氟甲基)苯甲醯胺(依據實例I-017步驟4合成)之四氫呋喃(15 mL)中，添加12.8 mg (0.06 mmol) 碘化亞銅(I)及171.0 (0.67 mmol) 碘(氬蒙氣下)，然後於室溫下，滴加64.8 mg (0.62 mmol) 亞硝酸第三丁酯處理反應混合物。然後於70°C溫度下攪拌反應混合物1 h。反應混合物使用乙酸乙酯處理，接著使用飽和NaCl溶液萃取。之後，真空蒸發溶劑，粗產物於矽膠上，使用環乙烷/丙酮梯度層析，產生22.0 mg (純度：99.0 %；產率：6 %)消旋性標題化合物及136.0 mg (純度：97.0 %；產率：46 %) 消旋性3-氯-*N*-[1-[2-(5-氯-2-吡啶基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]-5-(三氟甲基)苯甲醯胺之副產物。

方法 B：

【0247】 在含300.0 mg (0.67 mmol) *N*-[1-[5-胺基-2-(5-氯-2-吡啶基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]-3-氯-5-(三氟甲基)苯甲醯胺(依據實例I-017步驟4合成)之MeCN (10 mL)中，添加9.3 mg (34.7 mmol) 二碘甲烷(氬蒙氣下)，然後於室溫下，滴加319.6 mg (3.10 mmol) 亞硝酸第三丁酯處理反應混合物。然後於80°C溫度下攪拌反應混合物3 h。反應混合物使用乙酸乙酯處理，接著使用飽和NaCl溶液萃取。之後，真空蒸發溶劑，粗產物於矽膠上，使用環乙烷/丙酮梯度層析，產生268.1 mg (純度：100.0 %；產率：72 %)消旋性標題化合物。

分子式： $C_{17}H_{11}BrCl_2FIN_5O$

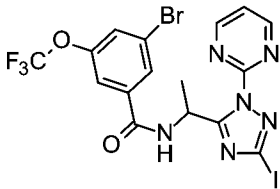
分子量：556.11 g/mol

HPLC-MS 酸(ESI 正電荷) [m/z]: 556.0 [M+H]⁺

¹H-NMR 波峰列表 (600 MHz, DMSO-d₆, ppm): δ = 9.3946 (1.4); 9.3829 (1.5); 8.6199 (2.4); 8.6191 (2.4); 8.6157 (2.5); 8.6148 (2.4); 8.1956 (2.0); 8.1913 (1.9);

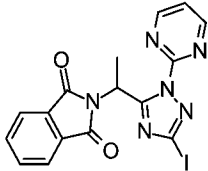
8.1811 (2.2); 8.1768 (2.2); 8.1195 (2.3); 8.1170 (1.6); 8.0712 (2.1); 8.0689 (1.5);
8.0609 (2.3); 7.8528 (2.7); 7.8520 (2.7); 7.8383 (2.5); 7.8374 (2.5); 5.9340 (1.1);
5.9224 (1.8); 5.9107 (1.1); 3.3185 (30.0); 3.2880 (0.3); 2.6146 (0.4); 2.5236 (0.7);
2.5206 (0.9); 2.5174 (0.9); 2.5087 (17.6); 2.5056 (38.0); 2.5025 (53.6); 2.4995 (39.5);
2.4965 (18.2); 2.3865 (0.3); 1.6176 (5.8); 1.6060 (5.8); 1.3975 (16.0); 1.2507 (1.1);
-0.0001 (2.9).

【0248】 3-溴-N-[1-(5-碘-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]-5-(三氟甲氧基)苯甲醯胺之合成法(實例I-020)



步驟 1

2-[1-(5-碘-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]異弓噪啉-1,3-二酮



【0249】 在含11.22 g (30.17 mmol) 2-[1-(5-胺基-2-嘓啉-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]異吲哚啉-1,3-二酮-鹽酸鹽之乙腈(448 ml) (依據實例I-001步驟1-3合成)中，添加180.95 g (675.64 mmol)二碘甲烷(氬蒙氣下)，然後於室溫下，滴加14.31 g (138.82 mmol) 亞硝酸第三丁酯處理反應混合物。然後於80 °C溫度下攪拌反應混合物3 h。反應混合物使用乙酸乙酯處理，接著使用飽和NaCl溶液萃取。之後，真空蒸發溶劑，粗產物於矽膠上，使用環乙烷/丙酮梯度層析，產生8.1 g (純度：99.1%；產率：60.2 %)消旋性標題化合物。

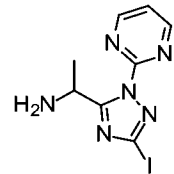
分子式： $\text{C}_{16}\text{H}_{11}\text{IN}_6\text{O}_2$

分子量：446,20 g/mol

HPLC-MS 酸(ESI 正電荷): 447.0 [M+H]⁺

步驟 2

1-(5-碘-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺 (INT-03)



【0250】 在3.07 g (6.89 mmol) 2-[1-(5-碘-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]異吲哚啉-1,3-二酮之乙醇(100 mL)中，添加1.56 g (17.2 mmol) 胼-水合物，反應混合物於回流下加熱。30分鐘後，有無色沉澱形成。攪拌反應混合物，再於回流下加熱2小時，添加丙酮(2 mL)，再繼續加熱30分鐘。反應混合物濃縮，使用乙醇處理固體殘質。過濾後，濾液減壓蒸發，產生消旋性中間物INT-003，其未純化即用於步驟3。

分子式：C₈H₉IN₆

分子量：316.10 g/mol

HPLC-MS 酸(ESI-正電荷) [m/z]: 316.9, 317.0 [M+H]⁺

步驟 3

3-溴-N-[1-(5-碘-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]-5-(三氟甲氧基)苯甲醯胺

【0251】 在含132.9 mg (0.37 mmol) (αS)-甲基-1-[3-碘-1-嘧啶基-1*H*-1,2,4-三唑]-5-甲胺、121.4 mg (0.41 mmol) 3-溴-5-(三氟甲氧基)-苯甲酸(純度：97%)、75.0 mg (0.58 mmol) DIPEA之3.65 g (50.0 mmol) DMF中，添加193.7 mg (0.51 mmol) HATU，反應混合物於室溫下攪拌一夜。反應混合物減壓濃縮，固體殘質使用二氯甲烷處理，接著使用飽和NaHCO₃水溶液及水萃取。分離有機相，經Na₂SO₄脫水，及減壓蒸發溶劑。殘留之固體殘質經HPLC，使用水/乙腈中性梯度純化，得到91.6 mg (純度：100 %；產率：38.0 %)消旋性標題化合物。

第 128 頁，共 162 頁(發明說明書)

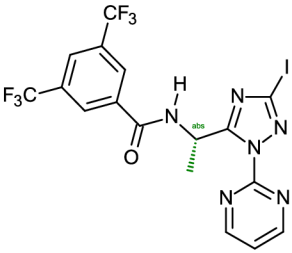
分子式：C₁₆H₁₁BrF₃IN₆O₂

分子量：583.11 g/mol

HPLC-MS 中性 (ESI-正電荷) [m/z]: 584.9 [M+H]⁺

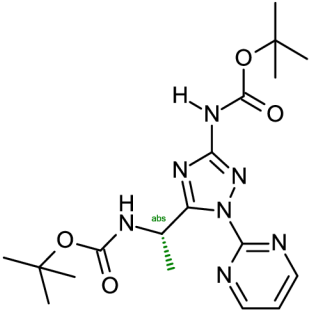
【0252】 下表1所列之式(I-021) – (I-025)化合物可依類似方法製備。

【0253】 *N*-[(1*S*)-1-(5-碘-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]-3,5-雙(三氟甲基)苯甲醯胺之合成法(實例I-027)



步驟 1

N-[5-[(1*S*)-1-(第三丁氧基羰基胺基)乙基]-1-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基]胺甲酸第三丁酯



【0254】 在含 6.1 g (32.2 mmol) *N*-Boc- 丙 胺 酸 (Boc-Ala-OH，購自 Sigma-Aldrich)及6.1 g (32.0 mmol) *N*-甲基-*N*-(甲基氫硫基-亞胺羰基)胺甲酸第三丁酯(ABCR GmbH產品列表：AB528361)之二噁烷 (20 mL)中，添加9.7 g (96.6 mmol) DIPEA及17.2 g (45.4 mmol) HATU，反應混合物於室溫下攪拌3小時。然後，在原位形成之*N*-[*N*-[(2*S*)-2-(第三丁氧基羰基胺基)丙醯基]-*C*-甲基氫硫基-亞胺羰基]-*N*-甲基-胺甲酸第三丁酯乙酸中添加5.0 g (45.4 mmol) 嘧啶-2-基肼，於 50°C溫度下攪拌反應混合物2 h。之後，反應混合物使用乙酸乙酯處理，接著使

用飽和NaCl水溶液及水萃取。分離有機相，經Na₂SO₄脫水，及減壓蒸發溶劑。殘留之粗產物於矽膠上，使用環乙烷/丙酮梯度層析，產生4.1 g (純度：90%；產率：23%)標題化合物。已測得對掌性標題化合物之對映異構性超量：ee-值 = 100%；R_t = 9.26 min.

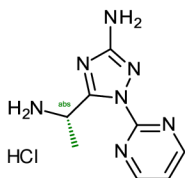
分子式： $\text{C}_{18}\text{H}_{27}\text{N}_7\text{O}_4$

分子量：405.46 g/mol

HPLC-MS 中性 $[m/z]$: 406.2 $[M+H]^+$

¹H-NMR 波峰列表 (400.2 MHz, d₆-DMSO, ppm): δ = 9.9069 (0.8); 8.9590 (1.5); 8.9469 (1.5); 8.7705 (0.7); 8.7670 (0.8); 8.7595 (0.8); 8.7560 (0.8); 8.5468 (0.9); 8.5433 (0.9); 8.5258 (1.0); 8.5223 (0.9); 7.6020 (0.9); 7.5899 (1.8); 7.5777 (0.9); 7.5330 (1.0); 7.5220 (1.0); 7.5120 (1.0); 7.5010 (0.9); 3.3288 (11.8); 2.8918 (1.3); 2.7332 (1.0); 2.7319 (1.1); 2.6904 (0.5); 2.5258 (0.4); 2.5210 (0.6); 2.5124 (9.4); 2.5078 (19.4); 2.5032 (25.9); 2.4986 (18.5); 2.4940 (8.7); 1.4523 (16.0); 1.4394 (1.3); 1.4219 (1.2); 1.4180 (1.2); 1.3977 (5.5); 1.3818 (0.3); 1.2936 (4.8); 1.2769 (0.4); 0.0080 (0.9); -0.0002 (28.6); -0.0086 (0.9).

步驟 2

5-[(1*S*)-1-胺基乙基]-1-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-胺-鹽酸鹽

【0255】 取7.2 g (17.7 mmol) *N*-[5-[(1*S*)-1-(第三丁氧基羰基氨基)乙基]-1-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基]胺甲酸第三丁酯溶於4*N* HCl-二噁烷溶液(150 mL)，及於室溫下攪拌混合物18 h。然後減壓蒸發溶劑，產生標題化合物，其可用於步驟3之偶合反應。

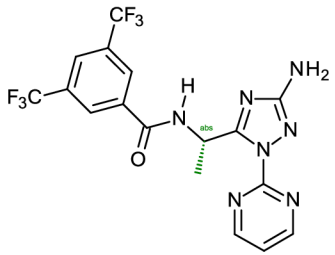
分子式： $C_8H_{11}N_7 HCl$

分子量：241.68 g/mol

HPLC-MS 酸(ESI-正電荷) [m/z]: 206.2 [M-HCl]⁺

步驟 3

N-[(1*S*)-1-(5-胺基-2-嘓啉-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]-3,5-雙(三氟甲基)苯甲醯胺



【0256】 在400 mg (1.55 mmol) 雙-3,5-(三氟甲基)-苯甲酸中，添加含260 mg (2.0 mmol) DIPEA之乙腈溶液(17.3 mL)及650 mg (1.7 mmol) HATU，攪拌反應混合物10分鐘。然後一起添加375 mg (1.55 mmol) 5-[(1*S*)-1-胺基乙基]-1-嘓啉-2-基-1,2,4-三唑-3-胺-鹽酸鹽與三乙基胺(1.0 ml)，於室溫下攪拌反應混合物一夜。反應混合物使用水處理，接著使用二氯甲烷萃取。分離之有機相經MgSO₄脫水及減壓濃縮。殘留之粗產物經製備性HPLC層析，產生150 mg (純度：93.5%；產率：22%)標題化合物。

分子式： $C_{17}H_{13}F_6N_7O$

分子量：445.33 g/mol

HPLC-MS 中性 (ESI-正電荷) [m/z]: 446.1 [M+H]⁺

步驟 4

N-[(1*S*)-1-(5-碘-2-嘓啉-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]-3,5-雙(三氟甲基)苯甲醯胺

【0257】 在含220 mg (0.49 mmol) *N*-[(1*S*)-1-(5-胺基-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]-3,5-雙(三氟甲基)苯甲醯胺之乙腈(20 ml)中，添加 270 mg (1.0 mmol) 二碘甲烷(氬蒙氣下)，然後於室溫下，滴加75 mg (0.72 mmol) 亞硝酸第三丁酯處理反應混合物。然後於70°C溫度下攪拌反應混合物2 h。反應混合物使用乙酸乙酯處理，接著使用飽和NaCl溶液萃取。之後，真空蒸發溶劑，粗產物經過HPLC層析，產生125 mg (純度：93.5%；產率：42.5 %)標題化合物。採用對掌性HPLC：Chiralcel OD-RH管柱(4.6 mm x 150 mm x 5 μm)測定對掌性標題化合物之對映異構性超量，於室溫下，以0.1%磷酸(A)及乙腈(B)，梯度A：B 95/5至10/90溶離，於210 nm下檢測：ee-值 = 97% (R_t = 10.98 min)。

分子式： $C_{17}H_{11}F_6IN_6O$

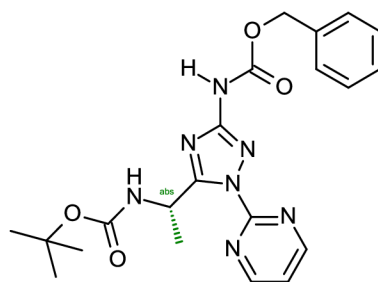
分子量：556,21 g/mol

HPLC-MS 酸(ESI 正電荷): 557.0 $[M+H]^+$

(1*S*)-1-(5-氯-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺-鹽酸鹽之合成法

步驟 1

N-[(1*S*)-1-[5-(苯甲基氧羰基胺基)-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基]乙基]胺甲酸第三丁酯



【0258】 在含 200 mg (1.05 mmol) *N*-Boc-丙胺酸 (Boc-Ala-OH，購自 Sigma-Aldrich) 及 240 g (1.07 mmol) *N*-[亞胺基(甲基硫)甲基]-胺甲酸苯基甲基酯 (Chemieliva Pharmaceutical 產品列表；訂購編號：CA1251032) 之 *N,N*-二甲基甲醯胺(5 mL) 中，添加 320 mg (3.16 mmol) DIPEA 及 600 mg (1.57 mmol) HATU，於室

溫下攪拌反應混合物3小時。然後在原位形成之*N*-[(1*S*)-2-[[苯甲基氧羰基胺基(甲基氫硫基)亞甲基]胺基]-1-甲基-2-側氧基-乙基]胺甲酸第三丁酯中，添加140 mg (1.27 mmol) 嘧啶-2-基肼及乙酸(0.25 mL)，於50°C溫度下攪拌反應混合物1 h。之後，反應混合物使用乙酸乙酯處理，接著使用飽和NaCl水溶液及水萃取。分離有機相，經Na₂SO₄脫水，及減壓蒸發溶劑。殘留之粗產物於矽膠上，使用環乙烷/丙酮梯度層析，產生239 mg (純度：96.5%；產率：47%)標題化合物。

分子式：C₂₁H₂₅N₇O₄

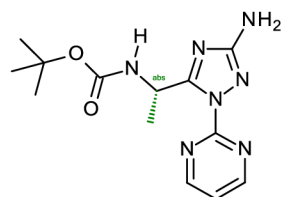
分子量：439.47 g/mol

LC-MS 中性 [m/z]: 440.2 [M+H]⁺

¹H-NMR 波峰列表 (600.1 MHz, d₆-DMSO, ppm): δ = 10.3936 (2.8); 8.9644 (3.7); 8.9564 (3.5); 7.6071 (2.6); 7.5990 (4.9); 7.5909 (2.5); 7.4600 (0.9); 7.4473 (1.0); 7.4405 (2.0); 7.4383 (2.6); 7.4265 (4.3); 7.4031 (2.7); 7.4000 (0.8); 7.3910 (4.7); 7.3782 (2.2); 7.3456 (1.5); 7.3370 (0.6); 7.3336 (1.9); 7.3215 (0.6); 5.5211 (0.5); 5.5092 (0.8); 5.4974 (0.6); 5.1592 (8.4); 3.3174 (105.4); 2.6190 (0.4); 2.6161 (0.7); 2.6130 (1.0); 2.6100 (0.7); 2.6071 (0.4); 2.5221 (2.2); 2.5190 (2.7); 2.5159 (2.8); 2.5070 (50.7); 2.5041 (106.9); 2.5010 (147.1); 2.4980 (108.0); 2.4950 (50.4); 2.3879 (0.6); 2.3849 (0.8); 2.3819 (0.6); 1.4435 (3.6); 1.4320 (3.3); 1.2872 (16.0); 1.0400 (0.9); -0.0001 (2.9)

步驟 2

N-[(1*S*)-1-(5-胺基-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]胺甲酸第三丁酯



【0259】 取560 mg (1.27 mmol) *N*-[(1*S*)-1-[5-(苯甲基氧羰基胺基)-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基]乙基]胺甲酸第三丁酯在50 g (46.9 mmol) 10% 鈀/碳(Aldrich)觸媒之存在下，在乙醇(10 mL)中，於室溫下氫化(5巴，16小時)。殘留之粗產物於矽膠上過濾，產生160 mg (純度：79%；產率：32%)標題化合物。

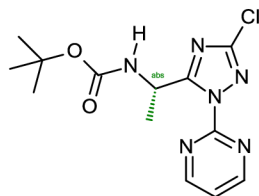
分子式： $C_{13}H_{19}N_7O_2$

分子量：305.34 g/mol

HPLC-MS 中性 $[m/z]$: 306.1 $[M+H]^+$

步驟 3

N-[(1*S*)-1-(5-氯-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]胺甲酸第三丁酯



【0260】 在含160.0 mg (0.52 mmol) *N*-[(1*S*)-1-(5-胺基-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]胺甲酸第三丁酯之乙腈(10 mL)中，添加130.0 mg (0.96 mmol) 氯化銅(II)，然後於室溫下，滴加80.0 mg (0.77 mmol) 亞硝酸第三丁酯處理反應混合物。然後於70°C溫度下攪拌反應混合物2 h。反應混合物使用乙酸乙酯處理，接著使用飽和NaCl溶液萃取。之後，真空蒸發溶劑，粗產物經過製備性HPLC層析，產生47.0 mg (產率：28 %)標題化合物。利用篩選(screen)OD_RH(酸)測定對掌性標題化合物之對映異構性超量：ee-值 = 80%； R_t = 9.37 min.

分子式： $C_{13}H_{17}ClN_6O_2$

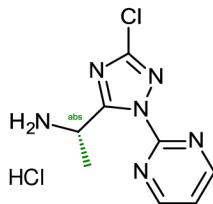
分子量：324.77 g/mol

^1H -NMR 波峰列表 (600.4 MHz, d_7 -DMF): δ = 9.0802 (3.6); 9.0725 (3.5); 8.0234 (40.3); 7.7498 (1.4); 7.7418 (2.7); 7.7338 (1.4); 7.4383 (0.8); 7.4266 (0.8); 5.6675

(0.6); 5.6561 (0.8); 5.6450 (0.6); 3.4532 (93.6); 2.9512 (0.8); 2.9207 (13.3); 2.9177 (27.1); 2.9146 (37.5); 2.9115 (27.7); 2.9086 (14.0); 2.7834 (0.8); 2.7503 (13.9); 2.7471 (28.0); 2.7440 (39.2); 2.7408 (28.5); 2.7376 (14.6); 1.5839 (5.6); 1.5725 (5.4); 1.3118 (16.0); 1.1391 (0.6); 0.0053 (2.3); -0.0001 (69.1); -0.0056 (2.8)

步驟 4

(1S)-1-(5-氯-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺-鹽酸鹽



【0261】 取337 mg g (1.03 mmol) *N*-[(1S)-1-(5-氯-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]胺甲酸第三丁酯溶於4N HCl-二噁烷溶液 (10 mL)，於室溫下攪拌混合物18 h。然後減壓蒸發溶劑，產生標題化合物，其可用於偶合反應。之後，蒸發溶劑，產生260.0 mg (產率：96 %)標題化合物。利用篩選(screen)OD_RH(酸)測定對掌性標題化合物之對映異構性超量：ee-值 = 100%； $R_t = 1.39$ min.

分子式：C₈H₉ClN₆ HCl

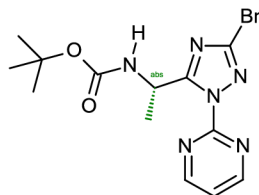
分子量：261.11 g/mol

HPLC-MS 酸(ESI-正電荷) [m/z]: 225.0 [M-HCl]⁺

【0262】 (1S)-1-(5-溴-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺-鹽酸鹽之合成法

步驟 1

N-[(1S)-1-(5-溴-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]胺甲酸第三丁酯



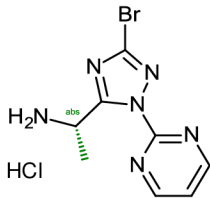
【0263】 在含500.0 mg (1.63 mmol) *N*-[*(1S)*-1-(5-胺基-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]胺甲酸第三丁酯之乙腈(20 mL)中，添加690.0 mg (3.08 mmol)溴化銅(II)，然後於室溫下，滴加250.0 mg (2.42 mmol) 亞硝酸第三丁酯處理反應混合物。然後於70°C溫度下攪拌反應混合物2 h。反應混合物使用乙酸乙酯處理，接著使用飽和NaCl溶液萃取。之後，真空蒸發溶劑，粗產物於矽膠上，使用環乙烷/丙酮梯度層析，產生333.0 mg (純度：100%；產率：55 %)標題化合物。利用篩選(screen)OD_{RH}(酸)測定對掌性標題化合物之對映異構性超量：ee-值 = 100%； $R_t = 9.63$ min.

分子式： $\text{C}_{13}\text{H}_{17}\text{BrN}_6\text{O}_2$ 分子量：369.22 g/mol

HPLC-MS 中性 $[m/z]: 369.0 [M+H]^+$

步驟 2

(1S)-1-(5-溴-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺-鹽酸鹽



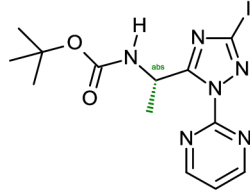
【0264】 取330 mg (0.89 mmol) *N*-[(1*S*)-1-(5-溴-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]胺甲酸第三丁酯溶於4N HCl-二噁烷溶液(10 mL)，於室溫下攪拌混合物18 h。然後減壓蒸發溶劑，產生250 mg (產率：91.5%)標題化合物，其可用於偶合反應。

分子式： $\text{C}_8\text{H}_9\text{BrN}_6\text{HCl}$ 分子量：305.57 g/mol

HPLC-MS 酸(ESI-正電荷) [m/z]: 270.9 [M-HCl]⁺

【0265】 (1S)-1-(5-碘-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺-鹽酸鹽之合成法
步驟 1

N-[(1S)-1-(5-碘-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]胺甲酸第三丁酯



【0266】 在含500.0 mg (1.63 mmol) *N*-[(1S)-1-(5-胺基-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]胺甲酸第三丁酯之乙腈(20 mL)中，添加 816.7 mg (3.04 mmol)二碘甲烷，然後於室溫下，滴加250.0 mg (2.42 mmol) 亞硝酸第三丁酯處理反應混合物。然後於70°C溫度下攪拌反應混合物2 h。反應混合物使用乙酸乙酯處理，接著使用飽和NaCl溶液萃取。之後，真空蒸發溶劑，粗產物經製備性HPLC 層析，產生 294.0 mg (純度：100%；產率：43 %)標題化合物。

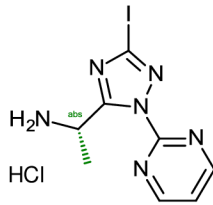
分子式：C₁₃H₁₇IN₆O₂

分子量：416.22 g/mol

HPLC-MS 中性 [m/z]: 417.0 [M+H]⁺

步驟 2

(1S)-1-(5-碘-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺-鹽酸鹽



【0267】 取290 mg (0.69 mmol) *N*-[(1S)-1-(5-碘-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]胺甲酸第三丁酯溶於4N HCl-二噁烷溶液(10 mL)中，於室溫下攪拌混合物18 h。然後減壓蒸發溶劑，產生標題化合物，其可用於偶合反應。利用篩選(screen)

OD_RH (酸)測定對掌性標題化合物之對映異構性超量： ee-值 = 100%； R_t = 1.41 min.

分子式：C₈H₉IN₆ HCl

分子量：352.56 g/mol

HPLC-MS 酸(ESI-正電荷) [m/z]: 317.0 [M-HCl]⁺

化合物之分析數據

【0268】 採用LC-MS在酸性層析條件下測定[M+H]⁺或M⁺，以每升乙腈含1 ml 甲酸及每升Millipore水含0.9 ml甲酸作為溶離液進行。採用管柱Zorbax Eclipse Plus C18 50 mm * 2.1 mm。管柱烘箱溫度為55°C。

【0269】 中間物化合物*N*-[5-[(1*S*)-1-(第三丁氧基羰基胺基)乙基]-1-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基]胺甲酸第三丁酯、*N*-[(1*S*)-1-(5-氯-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]胺甲酸第三丁酯、(1*S*)-1-(5-氯-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺-鹽酸鹽 [INT-04]、*N*-[(1*S*)-1-(5-溴-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙基]胺甲酸第三丁酯、(1*S*)-1-(5-碘-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺-鹽酸鹽 [INT-06]、及實例I-027之對映異構性超量係採用對掌性HPLC測定：Chiralcel OD-RH管柱(4.6 mm x 150 mm x 5 μm)，室溫，使用0.1%磷酸(A)及乙腈(B)，梯度A：B 95/5至10/90溶離，於210 nm下檢測。

【0270】 ¹H NMR數據之測定係採用加裝1.7 mm TCI低溫探針之Bruker Avance III 400 MHz、加裝5 mm多核低溫探針之Bruker Avance III 600 MHz、或加裝5 mm TCI 低溫探針之Bruker Avance NEO 600 MHz，使用四甲基矽烷作為參考物(0.0)及溶劑CD₃CN、CDCl₃或D₆-DMSO進行。

【0271】 所選定實例之NMR數據係以慣用形式(δ值，多裂峰，氫原子數)或以NMR波峰列表列出。

NMR波峰列表方法

【0272】 所選定實例之 ^1H NMR數據係以 ^1H NMR波峰列表型式呈現。每個訊號峰先列出 δ 值(ppm)，接著列出括號內之訊號強度。不同訊號峰列出之每對 δ 值－訊號強度數值之間彼此以分號分隔。

【0273】 因此某一實例之波峰列表型式為：

$\delta_1(\text{強度}_1)$ ； $\delta_2(\text{強度}_2)$ ；.....； $\delta_i(\text{強度}_i)$ ；.....； $\delta_n(\text{強度}_n)$ 。

【0274】 NMR光譜之印出實例中，陡峰訊號強度係與該訊號高度(以cm計)呈相關性，且顯示訊號強度之真實比例。以寬峰訊號為例，可以出示數個峰或中間訊號，及相較於光譜中最高強度峰之相對強度。

【0275】 校準 ^1H 光譜之化學位移時，採用四甲基矽烷與/或溶劑之化學位移，尤其在DMSO中測定光譜時。因此四甲基矽烷峰不一定會出現在NMR波峰列表中。

【0276】 ^1H NMR波峰列表類似慣用的 ^1H NMR特徵圖，因此通常包含列於慣用的NMR表示法中之所有波峰。

【0277】 此外，如同慣用的 ^1H NMR特徵圖，其等可顯示溶劑訊號、標的化合物之立體異構物(其亦同樣由本發明提供)訊號、及/或雜質之波峰。

【0278】 為了在溶劑與/或水之 δ -範圍內報告化合物訊號，吾等之 ^1H NMR波峰列表顯示標準溶劑波峰，例如：DMSO- D_6 中之DMSO之波峰，及水之波峰，其通常具有高的平均強度。

【0279】 標的化合物之立體異構物波峰與/或雜質波峰之平均強度通常低於標的化合物(例如：純度>90%)之波峰強度。

【0280】 此等立體異構物與/或雜質係典型出現在特定製法中。因此其等波峰有助於藉由「副產物指印」辨識吾等製法之再現性。

【0281】 可以採用已知方法(MestreC，ACD-模擬法，但亦可實驗性分析預期數值)計算標的化合物波峰之專家可依需要另外採用其他強度濾波器，單離出標的化合物之波峰。此單離法即類似慣用的 ^1H NMR表示法中相關波峰挑選法。

【0282】 ¹H NMR波峰列表之進一步詳細內容可參見Research Disclosure Database Number 564025。

【0283】 下表1所述根據本發明化合物同樣為依據或類似上述製備實例製得之根據本發明較佳式(I)化合物，其中R¹為氫，R³為甲基，X為氧，Y為直接鍵結，及R⁵為鹵素。

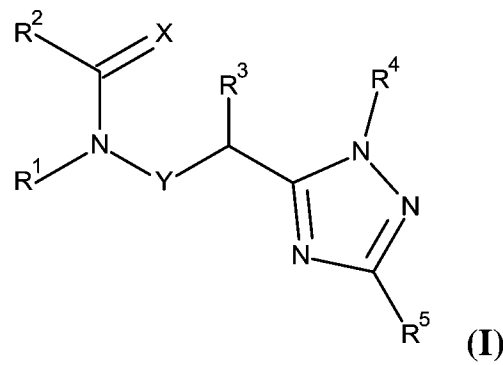
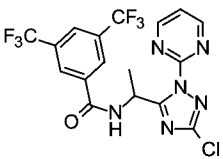
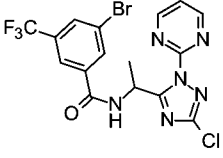
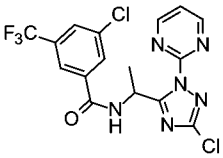
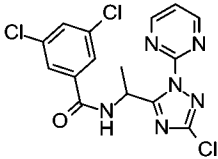
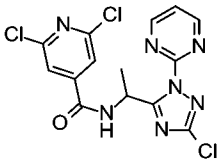
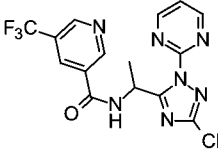
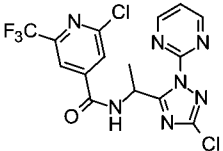
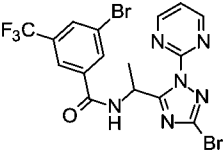


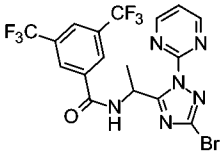
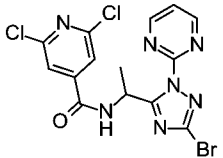
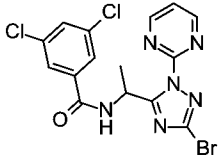
表 1

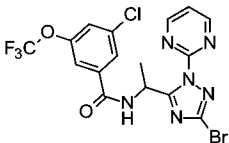
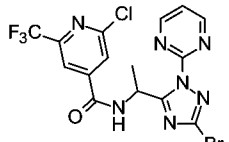
實例	結構式 ³⁾	NMR 波峰列表 ¹⁾	ESI 質量 [m/z] ²⁾
I-001		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.3731 (2.8); 9.3560 (2.8); 9.0039 (15.6); 8.9917 (16.0); 7.9183 (4.1); 7.9143 (6.4); 7.9104 (4.3); 7.7818 (4.4); 7.7025 (4.2); 7.7001 (4.5); 7.6774 (4.1); 7.6652 (7.8); 7.6531 (4.0); 5.9966 (0.5); 5.9795 (2.3); 5.9622 (3.5); 5.9449 (2.3); 5.9277 (0.5); 5.7577 (9.6); 3.3320 (119.6); 3.1765 (0.4); 3.1634 (0.3); 2.6774 (0.7); 2.6729 (1.0); 2.6684 (0.7); 2.5263 (3.4); 2.5128 (62.7); 2.5085 (123.2); 2.5040 (157.6); 2.4994 (113.4); 2.4950 (55.2); 2.3354 (0.7); 2.3307 (0.9); 2.3263 (0.6); 1.6512 (12.6); 1.6338 (12.6); 1.4302 (0.4); 0.0080 (0.4); -0.0002 (10.7); -0.0085 (0.4)	447.1 [M+H] ⁺

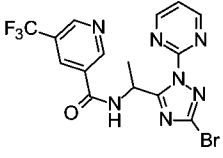
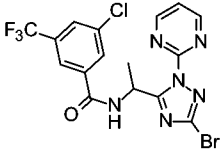
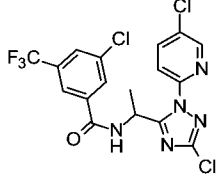
I-002		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.6096 (3.5); 9.5925 (3.6); 9.0108 (15.6); 8.9987 (16.0); 8.4228 (13.8); 8.3212 (6.1); 7.6795 (4.1); 7.6673 (7.9); 7.6552 (4.0); 6.0565 (0.6); 6.0396 (2.6); 6.0223 (4.0); 6.0050 (2.6); 5.9879 (0.6); 5.7574 (12.4); 3.3342 (185.5); 2.6780 (0.9); 2.6736 (1.2); 2.6691 (1.0); 2.5090 (161.7); 2.5046 (206.5); 2.5003 (155.9); 2.3314 (1.2); 2.3269 (0.9); 1.6837 (14.7); 1.6663 (14.6); 1.2341 (0.4); -0.0001 (9.3)	465.2 [M+H] ⁺
I-003		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.4530 (3.2); 9.4359 (3.2); 9.0071 (15.7); 8.9949 (16.0); 8.2610 (6.3); 8.1752 (5.9); 8.1010 (6.1); 7.6795 (4.2); 7.6673 (7.9); 7.6551 (4.0); 6.0163 (0.6); 5.9991 (2.5); 5.9818 (3.9); 5.9645 (2.5); 5.9473 (0.5); 5.7574 (12.1); 4.1070 (0.4); 4.0937 (0.4); 3.3733 (1.0); 3.3328 (180.6); 3.1763 (2.0); 3.1632 (2.0); 2.6772 (0.9); 2.6729 (1.2); 2.6683 (0.9); 2.5261 (4.6); 2.5084 (162.5); 2.5039 (205.6); 2.4994 (150.0); 2.3350 (0.9); 2.3308 (1.2); 2.3263 (0.9); 1.6878 (0.4); 1.6587 (14.1); 1.6413 (14.0); 0.0080 (0.5); -0.0002 (12.1); -0.0084 (0.5)	476.1 [M+H] ⁺
I-004		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.4573 (2.9); 9.4403 (3.0); 9.0074 (15.5); 8.9952 (16.0); 8.1287 (5.6); 8.0732 (11.6); 8.0711 (11.1); 7.6794 (4.1); 7.6672 (7.8); 7.6550 (4.0); 6.0194 (0.5); 6.0022 (2.3); 5.9849 (3.6); 5.9676 (2.3); 5.9502 (0.5); 5.7572 (12.7); 3.3359 (186.8); 3.1768 (0.9); 3.1637 (0.8); 2.6780 (0.7); 2.6733 (0.9); 2.6687 (0.7); 2.5267 (3.5); 2.5132 (63.2); 2.5090 (124.1); 2.5045 (159.1);	433.1 [M+H] ⁺

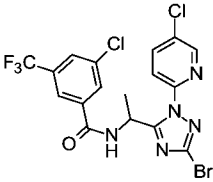
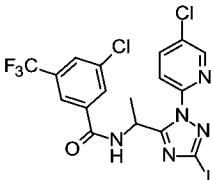
		2.4999 (115.8); 2.4956 (57.6); 2.3358 (0.7); 2.3312 (0.9); 2.3267 (0.7); 1.6612 (13.0); 1.6438 (12.9); -0.0001 (8.9); -0.0084 (0.3)	
I-005		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.3098 (2.2); 9.2926 (2.2); 9.0054 (13.0); 8.9932 (13.3); 7.9551 (0.3); 7.9503 (0.4); 7.8908 (0.4); 7.8150 (2.3); 7.8102 (5.1); 7.8057 (5.1); 7.7921 (16.0); 7.7874 (9.8); 7.6810 (3.4); 7.6688 (6.4); 7.6566 (3.3); 5.9842 (0.4); 5.9672 (1.8); 5.9499 (2.8); 5.9326 (1.8); 5.9152 (0.4); 5.7574 (10.7); 4.1061 (0.7); 4.0930 (0.7); 3.3316 (83.5); 3.1763 (4.1); 3.1632 (4.0); 2.6772 (0.5); 2.6728 (0.7); 2.6683 (0.5); 2.5262 (2.4); 2.5213 (3.9); 2.5127 (45.9); 2.5084 (91.2); 2.5038 (117.5); 2.4992 (84.8); 2.4948 (41.6); 2.3352 (0.5); 2.3306 (0.7); 2.3261 (0.5); 1.6395 (10.1); 1.6221 (10.1); -0.0002 (7.4)	398.1 [M+H] ⁺
I-006		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.5494 (1.5); 9.5325 (1.5); 9.0085 (7.8); 8.9963 (8.0); 7.8307 (16.0); 7.6870 (2.0); 7.6748 (3.9); 7.6627 (2.0); 5.9915 (1.3); 5.9743 (2.0); 5.9570 (1.3); 5.7567 (8.5); 3.3329 (63.9); 3.1760 (0.6); 3.1631 (0.6); 2.6772 (0.4); 2.6726 (0.5); 2.6682 (0.4); 2.5257 (2.0); 2.5123 (37.6); 2.5082 (71.4); 2.5038 (90.7); 2.4993 (66.0); 2.4950 (33.3); 2.3349 (0.4); 2.3306 (0.5); 2.3261 (0.4); 1.6458 (7.2); 1.6284 (7.1); 1.4371 (0.5); -0.0002 (4.1)	398.1 [M+H] ⁺
I-007		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.5391 (2.7); 9.5219 (2.7); 9.1787 (4.8); 9.1745 (4.9); 9.1280 (4.4); 9.1251 (4.4); 9.0139 (15.6); 9.0017 (16.0); 8.5107 (4.6); 7.6832 (4.1); 7.6711 (7.9); 7.6589 (4.0); 6.0517 (0.5); 6.0344 (2.3); 6.0171	398.1 [M+H] ⁺

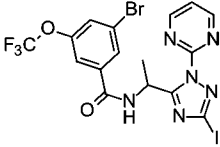
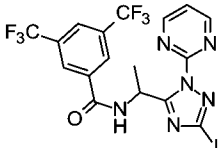
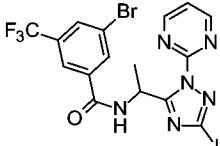
		(3.7); 5.9998 (2.3); 5.9822 (0.5); 5.7567 (13.4); 3.3372 (295.7); 3.1762 (0.5); 3.1631 (0.5); 2.6775 (0.8); 2.6729 (1.1); 2.6683 (0.8); 2.5263 (3.6); 2.5128 (71.7); 2.5085 (144.0); 2.5039 (186.9); 2.4994 (135.6); 2.4950 (66.7); 2.3353 (0.8); 2.3307 (1.1); 2.3262 (0.8); 1.6750 (13.0); 1.6576 (13.0); -0.0001 (4.9)	
I-008		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.6941 (2.5); 9.6771 (2.6); 9.0134 (14.0); 9.0013 (14.3); 8.1969 (6.5); 8.1944 (7.0); 8.1485 (6.7); 7.6888 (3.7); 7.6766 (7.0); 7.6645 (3.6); 6.0521 (0.4); 6.0347 (2.1); 6.0175 (3.3); 6.0002 (2.1); 5.9827 (0.5); 5.7575 (16.0); 3.3314 (91.0); 3.1763 (0.5); 3.1632 (0.5); 2.6775 (0.6); 2.6731 (0.8); 2.6685 (0.6); 2.5264 (3.0); 2.5129 (54.6); 2.5086 (107.6); 2.5041 (138.4); 2.4995 (99.9); 2.4952 (49.1); 2.3354 (0.6); 2.3309 (0.8); 2.3264 (0.6); 1.6694 (11.6); 1.6520 (11.6); -0.0002 (8.9); -0.0085 (0.3)	433.1 [M+H] ⁺
I-009		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.4495 (2.4); 9.4322 (2.4); 9.0031 (10.0); 8.9909 (10.1); 8.2588 (4.9); 8.1739 (4.7); 8.0991 (4.8); 7.6748 (2.6); 7.6627 (5.0); 7.6505 (2.5); 6.0197 (0.4); 6.0021 (1.7); 5.9847 (2.7); 5.9673 (1.8); 5.9502 (0.4); 5.7572 (16.0); 4.1049 (0.5); 4.0921 (0.5); 3.3301 (102.5); 3.1760 (2.9); 3.1629 (2.8); 2.6769 (0.9); 2.6725 (1.2); 2.6684 (0.9); 2.5078 (158.1); 2.5036 (196.3); 2.4993 (144.5); 2.3345 (0.8); 2.3303 (1.1); 2.3258 (0.8); 1.6529 (9.6); 1.6355 (9.5); -0.0002 (10.3)	521.0 [M+H] ⁺

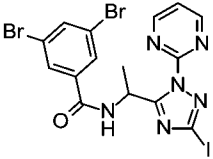
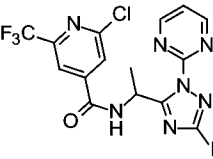
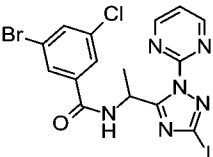
I-010		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.6078 (2.3); 9.5904 (2.3); 9.0060 (11.0); 8.9938 (11.2); 8.4199 (9.2); 8.3205 (4.1); 7.6738 (2.8); 7.6659 (1.4); 7.6617 (5.3); 7.6540 (0.8); 7.6495 (2.7); 6.0582 (0.4); 6.0414 (1.7); 6.0240 (2.7); 6.0067 (1.7); 5.9896 (0.4); 5.7552 (16.0); 3.3585 (302.0); 3.1772 (1.0); 3.1641 (1.0); 2.6790 (0.8); 2.6746 (1.1); 2.6700 (0.8); 2.5278 (4.3); 2.5142 (77.6); 2.5100 (149.3); 2.5056 (189.2); 2.5011 (138.2); 2.4969 (69.5); 2.3368 (0.8); 2.3324 (1.0); 2.3278 (0.8); 1.6780 (9.3); 1.6606 (9.2); 1.2343 (0.4); 0.0080 (0.3); -0.0002 (9.6); -0.0085 (0.4)	511.0 [M+H] ⁺
I-011		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.5460 (1.2); 9.5288 (1.2); 9.0050 (6.7); 8.9928 (6.7); 7.9562 (0.4); 7.8292 (14.8); 7.6829 (1.7); 7.6747 (0.8); 7.6707 (3.2); 7.6626 (0.4); 7.6586 (1.6); 5.9945 (1.0); 5.9772 (1.6); 5.9599 (1.0); 5.7571 (16.0); 3.3306 (25.7); 3.1757 (1.1); 3.1630 (1.0); 2.6770 (0.4); 2.6725 (0.5); 2.6680 (0.4); 2.5259 (1.9); 2.5124 (36.9); 2.5081 (72.5); 2.5035 (92.7); 2.4990 (66.8); 2.4946 (32.7); 2.3347 (0.4); 2.3304 (0.5); 2.3259 (0.4); 1.6403 (5.5); 1.6230 (5.4); -0.0002 (6.7)	444.1 [M+H] ⁺
I-012		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.3061 (2.5); 9.2888 (2.5); 9.0017 (12.2); 8.9896 (12.4); 7.8139 (2.7); 7.8093 (5.8); 7.8047 (5.3); 7.7902 (16.0); 7.7856 (10.3); 7.6767 (3.2); 7.6645 (6.1); 7.6523 (3.1); 5.9874 (0.4); 5.9700 (1.9); 5.9527 (3.0); 5.9354 (2.0); 5.9180 (0.4); 5.7572 (9.4); 4.1056 (0.8); 4.0926 (0.8); 3.3311 (101.9); 3.1761 (4.4); 3.1630 (4.3); 2.6771	443.0 (M+H) ⁺

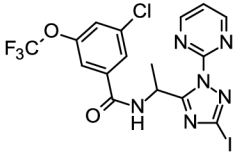
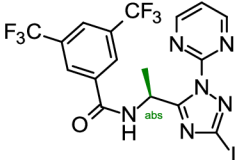
		(0.7); 2.6725 (1.0); 2.6681 (0.7); 2.5259 (3.6); 2.5121 (68.0); 2.5081 (129.7); 2.5036 (164.0); 2.4991 (118.8); 2.4949 (59.1); 2.3349 (0.7); 2.3304 (0.9); 2.3259 (0.7); 1.6338 (10.5); 1.6164 (10.5); 0.0080 (0.4); -0.0002 (10.1); -0.0085 (0.4)	
I-013		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10.1990 (1.2); 9.3700 (2.2); 9.3526 (2.2); 8.9997 (9.9); 8.9875 (10.1); 8.7208 (1.0); 8.7167 (1.0); 8.4424 (0.6); 8.4370 (0.6); 8.4209 (0.7); 8.4154 (0.6); 7.9149 (3.5); 7.9115 (4.9); 7.9077 (3.1); 7.8871 (1.0); 7.8656 (0.9); 7.8309 (8.6); 7.7802 (3.7); 7.6975 (3.7); 7.6725 (2.6); 7.6604 (5.0); 7.6482 (2.5); 6.1247 (0.8); 6.1070 (0.8); 5.9990 (0.4); 5.9820 (1.7); 5.9648 (2.6); 5.9474 (1.7); 5.9302 (0.4); 5.7569 (14.6); 3.3326 (148.0); 3.1761 (0.4); 3.1631 (0.4); 2.6771 (0.9); 2.6727 (1.2); 2.6683 (0.9); 2.5259 (4.2); 2.5081 (158.5); 2.5037 (200.2); 2.4993 (145.0); 2.3350 (0.8); 2.3304 (1.1); 2.3260 (0.8); 1.8223 (2.2); 1.8046 (2.3); 1.6453 (9.0); 1.6279 (8.9); 1.4664 (0.4); 1.4626 (0.4); 1.4461 (16.0); 0.0078 (0.4); -0.0002 (12.1)	492.1 [M+H] ⁺
I-014		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.6899 (1.1); 9.6728 (1.1); 9.0120 (1.7); 9.0086 (5.8); 8.9999 (1.8); 8.9965 (5.9); 8.1926 (3.2); 8.1458 (3.1); 7.6875 (0.4); 7.6834 (1.5); 7.6754 (0.8); 7.6713 (2.9); 7.6633 (0.5); 7.6591 (1.5); 6.0371 (0.9); 6.0197 (1.4); 6.0025 (0.9); 5.7566 (16.0); 3.3294 (97.0); 3.1754 (0.6); 3.1622 (0.6); 2.6763 (0.7); 2.6719 (0.9); 2.6673 (0.7); 2.5252 (3.4); 2.5117 (61.1); 2.5074 (119.5); 2.5029 (152.8); 2.4983	477.0 [M+H] ⁺

		(110.1); 2.4939 (53.9); 2.3341 (0.6); 2.3297 (0.8); 2.3251 (0.6); 1.6629 (4.8); 1.6455 (4.8); 0.0080 (0.4); -0.0002 (10.6); -0.0084 (0.4)	
I-015		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.5361 (3.2); 9.5189 (3.2); 9.1764 (6.2); 9.1272 (5.7); 9.0104 (14.9); 8.9982 (15.1); 8.5092 (5.7); 7.6790 (4.0); 7.6669 (7.5); 7.6590 (1.3); 7.6547 (3.8); 6.0550 (0.5); 6.0381 (2.5); 6.0207 (3.9); 6.0033 (2.5); 5.9860 (0.6); 5.7571 (16.0); 3.3363 (242.7); 3.1764 (0.6); 3.1633 (0.6); 2.6776 (0.9); 2.6731 (1.2); 2.6687 (0.9); 2.5262 (4.5); 2.5086 (156.2); 2.5042 (196.7); 2.4997 (142.2); 2.3355 (0.8); 2.3310 (1.1); 2.3264 (0.8); 1.6698 (13.7); 1.6524 (13.5); -0.0002 (2.6)	443.1 [M+H] ⁺
I-016		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.4539 (3.2); 9.4367 (3.3); 9.0069 (4.8); 9.0034 (15.7); 8.9948 (5.0); 8.9912 (16.0); 8.3168 (0.3); 8.1262 (6.4); 8.0715 (13.2); 8.0697 (12.6); 7.6790 (1.2); 7.6747 (4.2); 7.6668 (2.3); 7.6626 (7.8); 7.6548 (1.3); 7.6504 (4.0); 6.0220 (0.5); 6.0049 (2.4); 5.9876 (3.7); 5.9702 (2.4); 5.9527 (0.5); 5.7572 (12.8); 4.1075 (0.7); 4.0945 (0.7); 3.3341 (249.7); 3.1764 (3.2); 3.1633 (3.2); 2.6774 (1.0); 2.6730 (1.3); 2.6684 (1.0); 2.5262 (5.1); 2.5127 (88.6); 2.5084 (169.8); 2.5040 (216.0); 2.4994 (156.5); 2.4951 (77.0); 2.3352 (0.9); 2.3307 (1.2); 2.3262 (0.9); 1.6553 (12.9); 1.6379 (12.7); -0.0002 (7.2)	476.1 [M+H] ⁺
I-017		¹ H-NMR (600.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.4153 (2.5); 9.4039 (2.5); 8.6405 (4.4); 8.6397 (4.4); 8.6363 (4.6); 8.6354 (4.4); 8.2234 (3.8); 8.2191 (3.7); 8.2089 (4.1); 8.2045 (4.1); 8.1234 (4.3); 8.1208 (2.9);	465.1 [M+H] ⁺

		8.0758 (3.9); 8.0629 (4.2); 7.8635 (5.1); 7.8627 (5.0); 7.8490 (4.7); 7.8482 (4.6); 5.9368 (0.4); 5.9252 (2.1); 5.9137 (3.3); 5.9022 (2.2); 5.8906 (0.4); 3.3194 (43.3); 2.6183 (0.3); 2.6152 (0.5); 2.6122 (0.3); 2.5243 (1.0); 2.5212 (1.2); 2.5180 (1.2); 2.5093 (25.1); 2.5062 (54.5); 2.5031 (77.0); 2.5001 (56.8); 2.4971 (26.3); 2.3902 (0.3); 2.3871 (0.5); 2.3840 (0.3); 1.6404 (11.4); 1.6287 (11.5); 1.3975 (16.0); -0.0001 (4.0)	
I-018		¹ H-NMR (600.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.4115 (2.6); 9.4001 (2.7); 8.6396 (0.4); 8.6349 (4.7); 8.6311 (4.5); 8.6307 (4.4); 8.2163 (3.4); 8.2120 (3.3); 8.2089 (0.4); 8.2018 (3.6); 8.1975 (3.6); 8.1214 (4.6); 8.0745 (4.3); 8.0615 (4.7); 7.8651 (5.0); 7.8506 (4.6); 5.9417 (0.4); 5.9302 (2.0); 5.9253 (0.4); 5.9186 (3.2); 5.9139 (0.5); 5.9071 (2.1); 5.8955 (0.4); 3.3216 (92.2); 2.6184 (0.4); 2.6154 (0.5); 2.6124 (0.4); 2.5244 (1.1); 2.5214 (1.4); 2.5182 (1.5); 2.5094 (26.3); 2.5064 (55.2); 2.5033 (76.9); 2.5003 (57.3); 2.4973 (27.2); 2.3904 (0.4); 2.3873 (0.5); 2.3843 (0.3); 1.6353 (11.1); 1.6285 (2.0); 1.6237 (11.1); 1.3974 (16.0); -0.0001 (2.7).	510.0 [M+H] ⁺
I-019		¹ H-NMR (600.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.3946 (1.4); 9.3829 (1.5); 8.6199 (2.4); 8.6191 (2.4); 8.6157 (2.5); 8.6148 (2.4); 8.1956 (2.0); 8.1913 (1.9); 8.1811 (2.2); 8.1768 (2.2); 8.1195 (2.3); 8.1170 (1.6); 8.0712 (2.1); 8.0689 (1.5); 8.0609 (2.3); 7.8528 (2.7); 7.8520 (2.7); 7.8383 (2.5); 7.8374 (2.5); 5.9340 (1.1); 5.9224 (1.8); 5.9107 (1.1); 3.3185 (30.0); 3.2880 (0.3); 2.6146 (0.4); 2.5236 (0.7); 2.5206 (0.9);	556.0 [M+H] ⁺

		2.5174 (0.9); 2.5087 (17.6); 2.5056 (38.0); 2.5025 (53.6); 2.4995 (39.5); 2.4965 (18.2); 2.3865 (0.3); 1.6176 (5.8); 1.6060 (5.8); 1.3975 (16.0); 1.2507 (1.1); -0.0001 (2.9).	
I-020		¹ H-NMR (600.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.9866 (0.3); 8.9785 (0.3); 8.0377 (0.1); 7.6434 (0.2); 3.3274 (16.0); 2.5288 (0.2); 2.5258 (0.3); 2.5227 (0.3); 2.5137 (5.3); 2.5108 (10.9); 2.5078 (15.0); 2.5048 (11.3); 2.5022 (5.5); 1.6265 (0.3); 1.6149 (0.3)	584.9 [M+H] ⁺
I-021		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.5882 (3.2); 9.5705 (3.3); 9.0105 (0.6); 8.9981 (1.1); 8.9907 (15.6); 8.9785 (16.0); 8.4147 (12.1); 8.3168 (5.7); 7.6520 (4.1); 7.6399 (7.8); 7.6277 (4.0); 6.0534 (0.5); 6.0362 (2.3); 6.0187 (3.7); 6.0012 (2.3); 5.9840 (0.5); 5.7572 (12.3); 3.3331 (190.4); 3.1765 (0.8); 3.1634 (0.8); 2.6774 (1.0); 2.6730 (1.4); 2.6685 (1.0); 2.5262 (4.9); 2.5085 (178.1); 2.5041 (227.2); 2.4996 (165.9); 2.3353 (1.0); 2.3309 (1.3); 2.3264 (1.0); 1.6834 (0.6); 1.6590 (12.8); 1.6416 (12.8); 1.2335 (0.3); 0.0078 (0.4); -0.0002 (11.4); -0.0084 (0.5)	557.0 [M+H] ⁺
I-022		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.4315 (3.2); 9.4139 (3.3); 9.0068 (0.6); 8.9878 (15.7); 8.9756 (16.0); 8.2532 (6.1); 8.1704 (5.7); 8.0949 (5.9); 7.6530 (4.2); 7.6408 (7.8); 7.6286 (4.0); 6.0130 (0.5); 5.9956 (2.3); 5.9781 (3.6); 5.9606 (2.3); 5.9435 (0.5); 5.7570 (13.2); 3.3367 (288.3); 3.1763 (1.2); 3.1632 (1.2); 2.6774 (1.0); 2.6730 (1.3); 2.6685 (1.0); 2.5262 (5.2); 2.5126 (92.1); 2.5085 (175.4); 2.5041 (222.4); 2.4996 (162.1); 2.3350 (0.9); 2.3309 (1.3); 2.3263	566.9 [M+H] ⁺

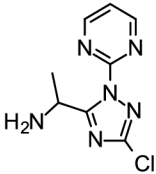
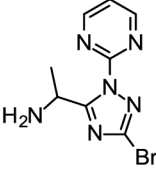
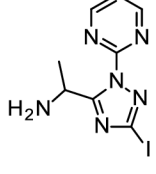
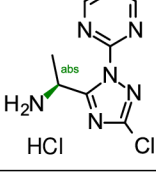
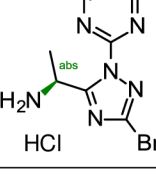
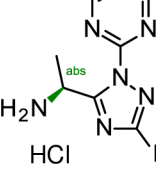
		(0.9); 1.6587 (0.6); 1.6345 (12.6); 1.6171 (12.5); -0.0002 (4.0)	
I-023		¹ H-NMR (600.4 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2600 (2.9); 9.2482 (3.0); 8.9988 (0.6); 8.9907 (0.7); 8.9805 (15.3); 8.9724 (15.6); 8.0218 (3.7); 8.0189 (7.2); 8.0160 (4.0); 7.9454 (0.9); 7.9399 (16.0); 7.9369 (15.0); 7.6476 (4.2); 7.6395 (8.0); 7.6314 (4.1); 5.9610 (0.5); 5.9494 (2.2); 5.9378 (3.6); 5.9261 (2.3); 5.9145 (0.5); 3.3058 (220.0); 3.2821 (0.3); 2.6185 (0.7); 2.6156 (1.4); 2.6126 (2.0); 2.6095 (1.4); 2.6065 (0.7); 2.5216 (4.7); 2.5185 (5.8); 2.5154 (5.7); 2.5066 (108.3); 2.5036 (227.7); 2.5006 (313.6); 2.4975 (229.2); 2.4945 (108.6); 2.3906 (0.6); 2.3876 (1.4); 2.3845 (1.9); 2.3815 (1.4); 2.3785 (0.6); 2.0722 (1.4); 1.6308 (0.5); 1.6192 (0.6); 1.6069 (12.1); 1.5953 (12.1); 0.0053 (0.8); -0.0001 (26.5); -0.0056 (0.8)	578.8 [M+H] ⁺
I-024		¹ H-NMR (400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.6720 (3.4); 9.6546 (3.4); 9.0130 (0.8); 8.9942 (15.4); 8.9821 (15.8); 8.1896 (8.8); 8.1400 (8.8); 7.6762 (0.4); 7.6623 (4.1); 7.6501 (7.7); 7.6380 (3.9); 6.0483 (0.5); 6.0309 (2.5); 6.0134 (3.9); 5.9961 (2.5); 5.9792 (0.6); 5.7569 (16.0); 3.3345 (250.1); 3.1760 (0.6); 3.1630 (0.6); 2.6771 (1.0); 2.6727 (1.4); 2.6684 (1.1); 2.5081 (193.8); 2.5038 (244.5); 2.4994 (180.1); 2.3350 (1.1); 2.3306 (1.4); 2.3263 (1.0); 1.6690 (0.8); 1.6452 (13.9); 1.6278 (13.8); -0.0002 (6.2)	524.0 [M+H] ⁺
I-025		¹ H-NMR (600.4 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2614 (2.9); 9.2495 (3.0); 8.9987 (0.4); 8.9907 (0.6); 8.9804 (15.0); 8.9723 (15.3); 7.9159 (0.8); 7.9108 (14.8); 7.9080 (16.0);	534.9 [M+H] ⁺

		7.8099 (4.4); 7.8071 (7.3); 7.8043 (3.8); 7.6472 (4.1); 7.6391 (7.8); 7.6310 (4.0); 5.9634 (0.5); 5.9520 (2.2); 5.9403 (3.5); 5.9286 (2.3); 5.9170 (0.5); 4.0798 (0.8); 4.0711 (0.8); 3.3269 (0.4); 3.3057 (377.4); 3.2815 (0.6); 3.1733 (3.2); 3.1645 (3.2); 2.6183 (1.0); 2.6154 (2.2); 2.6123 (3.1); 2.6093 (2.2); 2.6062 (1.0); 2.5364 (0.4); 2.5214 (7.2); 2.5183 (8.8); 2.5152 (8.6); 2.5064 (169.1); 2.5034 (354.0); 2.5003 (485.6); 2.4973 (355.9); 2.4943 (169.4); 2.3903 (1.0); 2.3873 (2.1); 2.3843 (3.0); 2.3812 (2.1); 2.3783 (1.0); 1.6326 (0.4); 1.6209 (0.5); 1.6087 (12.1); 1.5971 (12.2); 0.0053 (1.1); -0.0001 (34.7); -0.0057 (1.2)	
I-026		¹ H-NMR (600.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.9865 (0.2); 8.9784 (0.2); 7.6428 (0.1); 3.3299 (16.0); 2.5289 (0.2); 2.5258 (0.2); 2.5227 (0.2); 2.5137 (3.5); 2.5108 (7.2); 2.5078 (9.8); 2.5048 (7.4); 2.5020 (3.6); 1.6283 (0.2); 1.6167 (0.2)	538.9 [M+H] ⁺
I-027		¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.5883 (2.5); 9.5706 (2.5); 8.9925 (15.7); 8.9803 (16.0); 8.4169 (8.4); 8.3132 (3.7); 7.6535 (4.3); 7.6413 (8.0); 7.6291 (4.2); 6.0572 (0.4); 6.0399 (1.9); 6.0224 (3.0); 6.0049 (1.9); 5.9876 (0.4); 5.7573 (0.4); 3.3299 (65.9); 2.6794 (0.3); 2.6748 (0.4); 2.6702 (0.3); 2.5284 (1.6); 2.5236 (2.3); 2.5150 (26.4); 2.5105 (52.7); 2.5058 (69.0); 2.5012 (49.8); 2.4966 (23.7); 2.3327 (0.4); 1.6616 (10.0); 1.6442 (9.9); 0.1460 (0.4); 0.0080 (3.2); -0.0002 (92.8); -0.0086 (3.2); -0.1496 (0.4)	557.0 [M+H] ⁺

¹⁾ 「260 K」表示該測定係在 260 克耳文(Kelvin)溫度下進行。

- 2) 所述之質量對應於來自最高強度之[M+H]⁺離子之同位素型態之波峰。
- 3) 「abs」表示所得該化合物係呈富集對映異構性或呈純型，其中繪示具有絕對組態之主要立體異構物。

表 2 (中間物)

實例	結構式 ²⁾	ESI 質量 [m/z] ¹⁾
INT-01		225.1 [M+H] ⁺
INT-02		271.1 [M+H] ⁺
INT-03		316.9, 317.0 [M+H] ⁺
INT-04		225.0 [M-HCl] ⁺
INT-05		270.9 [M-HCl] ⁺
INT-06		317.0 [M-HCl] ⁺

1) 所述之質量對應於來自最高強度之[M+H]⁺離子之同位素型態之波峰。# 表示已記錄到[M-H]⁺離子。

2) 「abs」表示所得該化合物係呈富集對映異構性或呈純型，其中繪示具有絕對組態之主要立體異構物。

生物實例

【0284】 微小牛蜱(*Rhipicephalus (Boophilus) microplus*) – 牛蜱幼蟲之活體
外接觸試驗(物種Parkhurst, 對抗合成性擬除蟲菊酯之抗性)

【0285】 取9 mg活性化合物溶於1 ml丙酮中, 使用丙酮稀釋至所需濃度。取
250 µl試驗溶液填充至25 ml玻璃試管中, 在振盪器上傾斜旋轉, 使其均勻分佈在
內壁上(30 rpm下2 h)。在900 ppm化合物濃度及內表面44.7 cm²下, 均勻分佈後可
達到劑量為5 µg/cm²。

【0286】 蒸發溶劑後, 在每支試管中填入20-50隻微小牛蜱(*Rhipicephalus
microplus*)幼蟲, 使用多孔蓋封口, 呈水平位置於85 %相對濕度及27°C之培養箱
中培養。48 h後, 測定效力。把幼蟲拍落試管底部, 記錄負趨地性行為的幼蟲。
以相當於無處理對照組幼蟲之方式爬上試驗瓶頂端之幼蟲標記為存活, 無法以
相當於無處理對照組幼蟲之方式往上爬, 反而以不協調方式移動或僅能抽動腿
部之幼蟲則標記為垂死, 留在底部且完全不動之蜱幼蟲則計算為死亡。

【0287】 若追蹤化合物濃度5 µg/cm²之效力為至少80 %時, 則該化合物對抗微
小牛蜱(*Rhipicephalus microplus*)顯示良好效力。100 %效力 意指所有幼蟲均已死
亡或垂死; 0 % 意指沒有幼蟲死亡或垂死。

【0288】 本試驗中, 例如: 下列來自製備實例之化合物在5 µg/cm² (= 500 g/ha)
施用率下, 顯示100 %之良好活性: I-002、I-003、I-004、I-006、I-007、I-008、
I-009、I-010、I-012、I-015、I-017、I-020、I-021、I-022、I-024。

【0289】 本試驗中, 例如: 下列來自製備實例之化合物在5 µg/cm² (= 500 g/ha)
施用率下, 顯示90 %之良好活性: I-013、I-019。

【0290】 本試驗中, 例如: 下列來自製備實例之化合物在 5 µg/cm² (= 500 g/ha)
施用率下, 顯示 80 %之良好活性: I-016、I-018。

【0291】 微小牛蜱(*Rhipicephalus (Boophilus) microplus*) – 浸泡試驗
試驗動物: 微小牛蜱(*Rhipicephalus microplus*), 物種 Parkhurst, SP-抗性

溶劑： 二甲亞碲

【0292】 製造合適之活性化合物製劑時，取10 mg活性化合物溶於0.5 mL 溶劑，及加水稀釋該濃縮物所需濃度。

【0293】 取此化合物溶液滴加至試管中。取8-10隻充血之雌性微小牛蜱(*Rhipicephalus microplus*)成蟲置入多孔管中。此等試管浸入化合物水溶液中，直到牛蜱完全濕透。瀝乾液體後，取牛蜱移至塑膠盤中之濾紙上，存放在人工氣候室中。

【0294】 7天後，追蹤所產下可孵化的卵。看不出孵化力之卵係存放在人工氣候室內，直到約42天後孵化為止。100%之效力意指所有卵均無法孵化，0%意指所有卵均可孵化。

【0295】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在100 ppm施用率下，顯示80 %之良好活性：I-002。

【0296】 微小牛蜱(*Rhipicephalus (Boophilus) microplus*)-注射試驗

溶劑： 二甲亞碲

【0297】 製造合適之活性化合物製劑時，取10 mg活性化合物溶於0.5 mL 溶劑，及使用溶劑稀釋該濃縮物至所需濃度。

【0298】 在5隻充血之雌性微小牛蜱(*Rhipicephalus microplus*)成蟲腹部注射1μl化合物溶液。將牛蜱移至繁殖盤，在人工氣候室內培養。

【0299】 7天後，追蹤所產下可孵化的卵。看不出孵化力之卵係存放在人工氣候室內，直到約42天後孵化為止。100%之效力意指所有卵均無法孵化；0%意指所有卵均可孵化。

【0300】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在20 μg/隻動物之施用率下，顯示100 %之良好活性：I-002、I-003、I-004、I-005、I-017、I-018、I-019。

【0301】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在4 μg /隻動物之施用率下，顯示100 %之良好活性：I-002、I-003、I-004、I-005、I-007、I-008、I-009、I-010、I-013、I-014、I-015、I-016、I-017、I-019。

【0302】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在4 μg /隻動物之施用率下，顯示80 %之良好活性：I-006、I-012、I-018。

【0303】 貓櫛頭蚤(*Ctenocephalides felis*) – 貓蚤成蟲之活體外接觸試驗

【0304】 取9 mg化合物溶於1 ml丙酮中，使用丙酮稀釋至所需濃度。取250 μl 試驗溶液填充至25 ml玻璃試管中，在振盪器上傾斜旋轉，使其均勻分佈在內壁上(30 rpm下2 h)。在900 ppm化合物濃度及內表面44.7 cm^2 下，均勻分佈後可達到劑量為5 $\mu\text{g}/\text{cm}^2$ 。

【0305】 蒸發溶劑後，在每支試管中填入5-10隻貓櫛頭蚤(*Ctenocephalides felis*)成蟲，使用多孔蓋封口，呈平躺位置於室內溫度及相對濕度下培養。48 h後，測定效力。把貓蚤拍落試管底部，於45-50°C之加熱板上培養最多5 min。不動或以不協調方式移動而無法向上爬行躲避加熱的貓蚤則視為死亡或垂死。

【0306】 若追蹤化合物濃度5 $\mu\text{g}/\text{cm}^2$ 之效力為至少80 %時，則該化合物對抗貓櫛頭蚤(*Ctenocephalides felis*)顯示良好效力。100 %效力意指所有貓蚤已死亡或垂死；0 %意指沒有貓蚤死亡或垂死。

【0307】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在5 $\mu\text{g}/\text{cm}^2$ (= 500 g/ha)施用率下，顯示100 %之良好活性：I-006、I-020、I-021。

【0308】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在5 $\mu\text{g}/\text{cm}^2$ (= 500 g/ha)施用率下，顯示90 %之良好活性：I-008、I-013、I-024。

【0309】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在5 $\mu\text{g}/\text{cm}^2$ (= 500 g/ha)施用率下，顯示80 %之良好活性：I-009、I-010。

【0310】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在1 $\mu\text{g}/\text{cm}^2$ (= 100 g/ha)施用率下，顯示100 %之良好活性：I-002、I-020、I-021。

【0311】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在 $1\ \mu\text{g}/\text{cm}^2$ ($= 100\ \text{g}/\text{ha}$) 施用率下，顯示90 %之良好活性：I-008、I-013。

【0312】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在 $1\ \mu\text{g}/\text{cm}^2$ ($= 100\ \text{g}/\text{ha}$) 施用率下，顯示80 %之良好活性：I-014、I-024。

【0313】 **貓櫛頭蚤(*Ctenocephalides felis*)-口服試驗**

溶劑： 二甲亞碸

【0314】 製造合適之活性化合物製劑時，取10 mg活性化合物溶於0.5 mL 溶劑，及使用牛血稀釋該濃縮物至所需濃度。

【0315】 取約20隻未餵食之貓蚤成蟲(貓櫛頭蚤(*Ctenocephalides felis*))置入蚤試驗瓶中。在底部已使用石蠟膜封口之血液瓶中填充已包含化合物溶液之牛血，並置於覆蓋蚤試驗瓶頂端之紗布上，可讓跳蚤吸血。血液瓶加熱至 37°C ，而蚤瓶則保持在室溫下。

【0316】 兩天後，測定死亡率%。100%表示已殺死所有跳蚤；0%表示沒有殺死任何跳蚤。

【0317】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在100 ppm施用率下，顯示100 %之良好活性：I-002、I-003、I-005、I-006、I-007、I-008、I-009、I-010、I-012、I-013、I-014、I-015、I-016、I-020、I-021、I-023。

【0318】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在100 ppm施用率下，顯示90 %之良好活性：I-004、I-022。

【0319】 **血紅扇頭蜱(*Rhipicephalus sanguineus*) – 血紅扇頭蜱成蟲之活體外接觸試驗**

【0320】 取9 mg化合物溶於1 ml丙酮中，使用丙酮稀釋至所需濃度。取250 μl 試驗溶液填充至25 ml玻璃試管中，在振盪器上傾斜旋轉，使其均勻分佈在內壁

上(30 rpm下2 h)。在900 ppm化合物濃度及內表面44.7 cm²下，均勻分佈後可達到劑量為5 µg/cm²。

【0321】 蒸發溶劑後，在每支試管中填入5-10隻血紅扇頭蜱(*Rhipicephalus sanguineus*)成蟲，使用多孔蓋封口，呈平躺位置於室內溫度及相對濕度下培養。48 h後，測定效力。將蜱拍落在試管底部，於45-50°C之加熱板上培養最多5 min。不動或以不協調方式移動而無法向上爬行躲避加熱的蜱則視為死亡或垂死。

【0322】 若追蹤化合物濃度5 µg/cm²之效力為至少80 %時，則該化合物對抗血紅扇頭蜱(*Rhipicephalus sanguineus*)顯示良好效力。100 %效力意指所有蜱均已死亡或垂死；0 % 意指沒有蜱死亡或垂死。

【0323】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在5 µg/cm² (= 500 g/ha)施用率下，顯示100 %之良好活性：I-003、I-004、I-005、I-007、I-008、I-009、I-010、I-012、I-014、I-020。

【0324】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在5 µg/cm² (= 500 g/ha)施用率下，顯示80 %之良好活性：I-002、I-006、I-013、I-021、I-022、I-024。

【0325】 黃瓜條葉甲(*Diabrotica balteata*)—噴灑試驗

溶劑： 78.0 份重量比之丙酮
1.5 份重量比之二甲基甲醯胺
乳化劑： 烷基芳基聚二醇醚

【0326】 製造合適之活性化合物製劑時，取1份重量比活性化合物與指定量溶劑混合，及使用包含乳化劑濃度1000 ppm之水稀釋該濃縮物至所需濃度。使用包含乳化劑之水稀釋製成其他試驗濃度。

【0327】 取預先吸水膨脹之小麥種子(*Triticum aestivum*)置於已填充洋菜及一些水之多凹孔盤中，培養一天至發芽(每個孔5粒種子)。使用含有所需活性成份

濃度之試驗溶液噴灑發芽之小麥種子。隨後，在每個單位中感染10-20隻黃瓜條葉甲(*Diabrotica balteata*)幼蟲。

【0328】 7天後，測定效力%。100%意指所有幼苗之生長如同未處理、未感染之對照組；0%意指沒有任何幼苗生長。

【0329】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在100 g/ha (= 32 µg/孔)之施用率下，顯示100 %之良好活性：I-001、I-002、I-003、I-004、I-005、I-006、I-009、I-013、I-014、I-016、I-017、I-018、I-019、I-020、I-021、I-022、I-024。

【0330】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在100 g/ha (= 32 µg/孔)之施用率下，顯示80 %之良好活性：I-008、I-010、I-015。

【0331】 桃赤蚜(*Myzus persicae*) –口服試驗

溶劑： 100 份重量比之丙酮

【0332】 製造合適之活性化合物製劑時，取1份重量比活性化合物與指定量溶劑混合，及加水稀釋該濃縮物至所需濃度。

【0333】 取50 µl化合物溶液填入微量滴定板中，添加150 µl IPL41昆蟲培養基(33% + 15%糖)，得到每孔總體積200 µl。隨後使用石蠟膜密封滴定板，讓桃赤蚜(*Myzus persicae*)之混合族群可以透過石蠟膜吸取化合物製劑。

【0334】 5天後測定死亡率%。100%意指已殺死所有蚜蟲，及0%意指未殺死任何蚜蟲。

【0335】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在4 ppm之施用率下，顯示100 %之良好活性：I-001、I-002、I-003、I-004、I-009、I-010、I-013、I-016、I-020、I-021、I-022。

【0336】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在4 ppm之施用率下，顯示90 %之良好活性：I-006、I-007。

【0337】 桃赤蚜(*Myzus persicae*)-噴灑試驗

溶劑： 78.0 份重量比之丙酮
1.5 份重量比之 二甲基甲醯胺
乳化劑： 烷基芳基聚二醇醚

【0338】 製造合適之活性化合物製劑時，取1份重量比活性化合物與指定量溶劑混合，及使用包含乳化劑濃度1000 ppm之水稀釋至所需濃度。使用包含乳化劑之水稀釋製成其他試驗濃度。

【0339】 在已感染所有蟲齡之桃赤蚜(*Myzus persicae*)之捲心白菜(*Brassica pekinensis*)葉圓片上噴灑所需濃度之活性成份製劑。

【0340】 5天後，測定死亡率%。100%意指已殺死所有蚜蟲，及0%意指未殺死任何蚜蟲。

【0341】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在100 g/ha之施用率下，顯示90 %之良好活性：I-001、I-006、I-007、I-010、I-020、I-021。

【0342】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在100 g/ha之施用率下，顯示70 %之良好活性：I-009。

【0343】 南方綠蝽象(*Nezara viridula*) –噴灑試驗

溶劑： 78.0 份重量比之丙酮
1.5 份重量比之二甲基甲醯胺
乳化劑： 烷基芳基聚二醇醚

【0344】 製造合適之活性化合物製劑時，取1份重量比活性化合物與指定量溶劑混合，及使用包含乳化劑濃度1000 ppm之水稀釋該濃縮物至所需濃度。使用包含乳化劑之水稀釋製成其他試驗濃度。

【0345】 在感染南方綠蝽象(*Nezara viridula*)幼蟲之大麥植株(*Hordeum vulgare*)上噴灑含有所需濃度之活性成份之試驗溶液。

【0346】 4天後，測定死亡率%。100 %意指已殺死所有蝽象；0%意指沒有殺死任何蝽象。

【0347】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在100 g/ha之施用率下，顯示100 %之良好活性：I-008、I-024。

【0348】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在100 g/ha之施用率下，顯示90 %之良好活性：I-007。

【0349】 秋行軍蟲(*Spodoptera frugiperda*)-噴灑試驗

溶劑： 78.0 份重量比之丙酮

1.5 份重量比之二甲基甲醯胺

乳化劑： 烷基芳基聚二醇醚

【0350】 製造合適之活性化合物製劑時，取1份重量比活性化合物與指定量溶劑混合，及使用包含乳化劑濃度1000 ppm之水稀釋至所需濃度。使用包含乳化劑之水稀釋製成其他試驗濃度。

【0351】 在玉米(*Zea mays*)葉片上噴灑所需濃度之活性成份製劑。乾燥時，在葉片上感染秋行軍蟲(*Spodoptera frugiperda*)幼蟲。

【0352】 7天後，測定死亡率%。100%表示已殺死所有幼蟲；0%表示沒有殺死任何幼蟲。

【0353】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在100 g/ha之施用率下，顯示100 %之良好活性：I-001、I-002、I-003、I-004、I-005、I-010、I-013、I-016、I-019、I-020、I-021、I-022。

【0354】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在100 g/ha之施用率下，顯示83 %之良好活性：I-017、I-018。

【0355】 本試驗中，例如：下列來自製備實例之化合物在100 g/ha之施用率下，顯示67 %之良好活性：I-009。

【0356】 埃及斑蚊(*Aedes aegypti*)試驗(AEDSAE表面處理與接觸分析法)
溶劑：丙酮 + 2000 ppm 菜籽油甲酯(RME)

【0357】 為了製成含有足量活性成份之溶液，必需讓試驗化合物溶於溶劑混合物(丙酮2 mg/ml / RME 2000 ppm)中。吸取此溶液加至上釉瓷板上，待丙酮蒸發後，在乾燥表面上放置埃及斑蚊(*Aedes aegypti*)品系MONHEIM成蟲。曝露時間為30分鐘。在昆蟲接觸處理表面後24小時，測定死亡率百分比(%)。100%死亡率意指所有試驗昆蟲均死亡，而0%意指沒有昆蟲死亡。

【0358】 本試驗中，下列實例在表面濃度20 mg/m²下，顯示80-100%之效力：I-001、I-002、I-003、I-004、I-007、I-010、I-013、I-016、I-018、I-021。

【0359】 本試驗中，下列實例在表面濃度4 mg/m²下，顯示80-100%之效力：I-001、I-002、I-004、I-007、I-008、I-012、I-021。

【0360】 致死按蚊(*Anopheles funestus*)試驗(ANPHFU表面處理與接觸分析法)
溶劑：丙酮+ 2000 ppm 菜籽油甲酯(RME)

【0361】 為了製成含有足量活性成份之溶液，必需讓試驗化合物溶於溶劑混合物(丙酮2 mg/ml / RME 2000 ppm)中。吸取此溶液加至上釉瓷板上，待丙酮蒸發後，在乾燥表面上放置致死按蚊(*Anopheles funestus*)品系FUMOZ-R成蟲(Hunt等人，Med Vet Entomol. 2005 Sep; 19(3):271-5)。曝露時間為30分鐘。在昆蟲接觸處理表面後24小時，測定死亡率百分比(%)。100%死亡率意指所有試驗昆蟲均死亡，而0%意指沒有昆蟲死亡。

【0362】 本試驗中，下列實例在表面濃度 20 mg/m^2 下，顯示80-100%之效力：
I-001、I-007、I-013、I-016、I-018。

【0363】 家蠅(*Musca domestica*)試驗(MUSCDO表面處理與接觸分析法)
溶劑：丙酮 + 2000ppm 菜籽油甲酯(RME)

【0364】 為了製成含有足量活性成份之溶液，必需讓試驗化合物溶於溶劑混合物(丙酮 2 mg/ml / RME 2000 ppm)中。吸取此溶液加至上釉瓷板上，待丙酮蒸發後，在乾燥表面上放置家蠅(*Musca domestica*)品系WHO-N成蟲。曝露時間為30分鐘。在昆蟲接觸處理表面後24小時，測定死亡率百分比(%)。100%死亡率意指所有試驗昆蟲均死亡，而0%意指沒有昆蟲死亡。

【0365】 本試驗中，下列實例在表面濃度 20 mg/m^2 下，顯示80-100%之效力：
I-001、I-002、I-003、I-010、I-013、I-019、I-021。

【0366】 本試驗中，下列實例在表面濃度 4 mg/m^2 下，顯示80-100%之效力：
I-001、I-003、I-021。

【0367】 德國蜚蠊(*Blattella germanica*)試驗(BLTTGE表面處理與接觸分析法)
溶劑：丙酮 + 2000ppm 菜籽油甲酯(RME)

【0368】 為了製成含有足量活性成份之溶液，必需讓試驗化合物溶於溶劑混合物(丙酮 2 mg/ml / RME 2000 ppm)中。吸取此溶液加至上釉瓷板上，待丙酮蒸發後，在乾燥表面上放置德國蜚蠊(*Blattella germanica*)品系PAULINIA成蟲。曝露時間為30分鐘。在昆蟲接觸處理表面後24小時，測定死亡率百分比(%)。100%死亡率意指所有試驗昆蟲均死亡，而0%意指沒有昆蟲死亡。

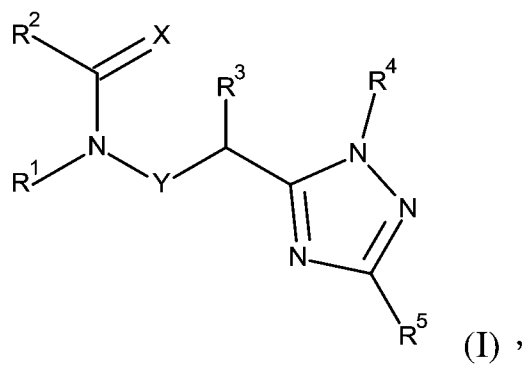
【0369】 本試驗中，下列實例在表面濃度 20 mg/m^2 下，顯示80-100%之效力：
I-002、I-003、I-016、I-021。

【符號說明】

【0370】 無

【發明申請專利範圍】

【請求項1】 一種式(I)化合物



其中

- X 為O或S；
- Y 為直接鍵結或CH₂；
- R¹ 為氫；C₁-C₆烷基，其可視需要經選自下列之一個取代基取代：
-CN、-CONH₂、-COOH、-NO₂及-Si(CH₃)₃；C₁-C₆鹵烷基；C₂-C₆烯基；C₂-C₆鹵烯基；C₂-C₆炔基；C₂-C₆鹵炔基；C₃-C₄環烷基-C₁-C₂烷基-，其中C₃-C₄環烷基可視需要經一個或兩個鹵原子取代；氧雜環丁烷-3-基-CH₂-或苯甲基，其可視需要經鹵原子或C₁-C₃鹵烷基取代；
- R² 為苯基、吡啶、嘧啶、吡嗪或嗒嗪，其中苯基、吡啶、嘧啶、吡嗪或嗒嗪可視需要經一至三個取代基取代，其限制條件為該(等)取代基並不位在C=X-基團所鍵結碳之任一相鄰碳上，其分別獨立選自下列各項所組成群組中：C₁-C₃烷基、C₁-C₃鹵烷基、C₁-C₃鹵烷基硫、C₁-C₃烷氧基、C₁-C₃鹵烷氧基、鹵素、-NO₂、-SF₅、-CN、-CONH₂、-COOH及-C(S)NH₂；
- R³ 為C₁-C₃烷基或C₁-C₃鹵烷基；
- R⁴ 為吡啶、嘧啶、吡嗪或嗒嗪，其中吡啶、嘧啶、吡嗪或嗒嗪可視需要經選自下列各項所組成群組中之一個取代基取代：C₁-C₃烷基、C₁-C₃鹵烷基、C₁-C₃烷氧基、C₃-C₄環烷基、鹵素或羥基；

R⁵ 為鹵素。

【請求項2】 如請求項1之化合物，其中

X 為O或S；

Y 為直接鍵結或CH₂；

R¹ 為氫；C₁-C₃烷基，其可視需要經選自下列之一個取代基取代：
-CN、-CONH₂、-COOH、-NO₂及-Si(CH₃)₃；C₁-C₃鹵烷基；C₂-C₄
烯基；C₂-C₄鹵烯基；C₂-C₄炔基；C₂-C₄鹵炔基；C₃-C₄環烷基-C₁-C₂
烷基-，其中C₃-C₄環烷基可視需要經一個或兩個鹵原子取代；氧
雜環丁烷-3-基-CH₂-；或苯甲基，其可視需要經鹵原子或C₁-C₃
鹵烷基取代；

R² 為苯基、吡啶、嘧啶、吡嗪或嗒嗪，其中苯基、吡啶、嘧啶、吡
嗪或嗒嗪可視需要經一至三個取代基取代，其限制條件為該(等)
取代基並不位在C=X-基團所鍵結碳之任一相鄰碳上，其分別獨
立選自下列各項所組成群組中：C₁-C₃烷基、C₁-C₃鹵烷基、C₁-C₃
鹵烷基硫、C₁-C₃烷氧基、C₁-C₃鹵烷氧基、鹵素、-NO₂、-SF₅、
-CN、-CONH₂、-COOH及-C(S)NH₂；

R³ 為C₁-C₃烷基或C₁-C₃鹵烷基；

R⁴ 為吡啶、嘧啶、吡嗪或嗒嗪，其中吡啶、嘧啶、吡嗪或嗒嗪可視
需要經選自下列各項所組成群組中之一個取代基取代：C₁-C₃烷
基、C₁-C₃鹵烷基、C₁-C₃烷氧基、C₃-C₄環烷基、鹵素或羥基；

R⁵ 為鹵素。

【請求項3】 如請求項1或2之化合物，其中

X 為O；

Y 為直接鍵結；

R¹ 為氫；

R^2 為苯基或吡啶，其中苯基或吡啶可視需要經一至三個取代基取代，其限制條件為該(等)取代基並不位在C=X-基團所鍵結碳之任一相鄰碳上，其分別獨立選自下列各項所組成群組中：氟、氯、溴、-CN、-NO₂、-SF₅、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、二氟甲氧基、二氟甲基硫、及三氟甲基硫；

R^3 為C₁-C₃烷基；

R^4 為吡啶或嘧啶，其中吡啶或嘧啶可視需要經選自下列各項所組成群組中之一個取代基取代：氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基；

R^5 為氟、氯、溴、或碘。

【請求項4】 如請求項1至3中任一項之化合物，其中

X 為O；

Y 為直接鍵結；

R^1 為氫；

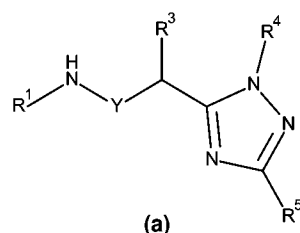
R^2 3-氯-5-(三氟甲基)苯基、3-溴-5-(三氟甲基)苯基、3-氯-5-(三氟甲氧基)苯基、3-溴-5-(三氟甲氧基)苯基、3-溴-5-氯苯基、3,5-二氯苯基、3,5-二溴苯基、3,5-雙(三氟甲基)苯基、2,6-二氯-吡啶-4-基、5-(三氟甲基)-吡啶-3-基、或2-氯-6-(三氟甲基)-吡啶-4-基；

R^3 為甲基；

R^4 為嘧啶-2-基、或5-氯-吡啶-2-基；

R^5 為氯、溴或碘。

【請求項5】 一種式(a)化合物，其中 R^1 為氫， R^3 為甲基，及Y為直接鍵結，及其中 R^4 及 R^5 具有如請求項3中指示之定義或如請求項4中指示之定義。



【請求項6】 一種化合物，為1-(5-氯-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺、1-(5-溴-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺、1-(5-碘-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺、(1S)-1-(5-氯-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺-鹽酸鹽、(1S)-1-(5-溴-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺-鹽酸鹽、及(1S)-1-(5-碘-2-嘧啶-2-基-1,2,4-三唑-3-基)乙胺-鹽酸鹽。

【請求項7】 一種調配物，特別係農化調配物，其包含至少一種如請求項1至4中任一項之式(I)化合物。

【請求項8】 如請求項6之調配物，其進一步包含至少一種補充劑及/或至少一種表面活性物質。

【請求項9】 如請求項6或7之調配物，其特徵在於該式(I)化合物係與至少一種其他活性化合物形成混合物。

【請求項10】 一種防治害蟲一特別係動物害蟲一之方法，其特徵在於由如請求項1至4中任一項之式(I)化合物或如請求項6至8中任一項之調配物作用在害蟲及/或其棲息地上，其中不包括人體或動物體之手術或治療之方法及在人體或動物體上進行之診斷方法。

【請求項11】 如請求項9之方法，其特徵在於該害蟲為動物害蟲，且包括昆蟲、蛛形類或線蟲，或在於該害蟲為昆蟲、蛛形類或線蟲，其中不包括人體或動物體之手術或治療之方法及在人體或動物體上進行之診斷方法。

【請求項12】 一種以如請求項1至4中任一項之式(I)化合物或如請求項6至8中任一項之調配物於防治動物害蟲上之用途，其中不包括用於人體或動物體之手術或治療之方法及在人體或動物體上進行之診斷方法上之用途。

【請求項13】 如請求項11之用途，其特徵在於該動物害蟲包括昆蟲、蛛形類或線蟲，或在於該動物害蟲為昆蟲、蛛形類或線蟲，其中不包括用於人體或動物體之手術或治療之方法及在人體或動物體上進行之診斷方法上之用途。

【請求項14】 如請求項11或12之用途，其係用於保護作物。

【請求項15】 如請求項11或12之用途，其係用於動物健康領域，其中不包括用於人體或動物體之手術或治療之方法及在人體或動物體上進行之診斷方法上之用途。

【請求項16】 一種保護種子或發芽之植物免於害蟲一特別係動物害蟲一侵害之方法，其包括之方法步驟中係由種子與如請求項1至4中任一項之式(I)化合物或與如請求項6至8中任一項之調配物接觸。

【請求項17】 一種以請求項15之方法得到之種子。