(19)中華民國智慧財產局
(12)發明說明書公開本 (11)公開編號：TW 201012817 A1
(43)公開日： 中華民國 99 (2010) 年 04 月 01 日

(21)申請案號：098120881 (22)申請日： 中華民國 98 (2009) 年 06 月 22 日
(51)Int. Cl.： *C07D417/06 (2006.01)* *A01N43/80 (2006.01)*
A01N43/40 (2006.01) *A01P5/00 (2006.01)*
A01P7/04 (2006.01)
(30)優先權：2008/06/23 美國 61/074,822
(71)申請人：巴地斯顏料化工廠 (德國) BASF SE (DE)
德國
(72)發明人：保林那 羅芙 PAULINI, RALPH (DE)；伯紐寧爵 達芬 BREUNINGER, DELPHINE (FR)；凡 迪恩 沃夫崗 VON DEYN, WOLFGANG (DE)；巴斯提恩斯 亨利克斯 瑪利亞 馬提納斯 BASTIAANS, HENRICUS MARIA MARTINUS (NL)；貝爾 卡斯登 BEYER, CARSTEN (DE)；安斯波 道格拉斯D ANSPAUGH, DOUGLAS D. (US)；歐羅梅 薩德基 哈珊 OLOUMI-SADEGHI, HASSAN (US)
(74)代理人：陳長文
申請實體審查：無 申請專利範圍項數：27 項 圖式數：0 共 188 頁

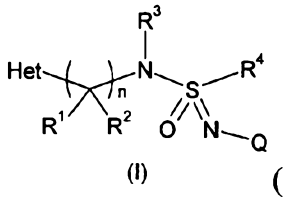
(54)名稱

對抗動物害蟲之磺醯亞胺基胺（ＳＵＬＦＯＸＩＭＩＮＡＭＩＤＥ）化合物

SULFOXIMINAMIDE COMPOUNDS FOR COMBATING ANIMAL PESTS

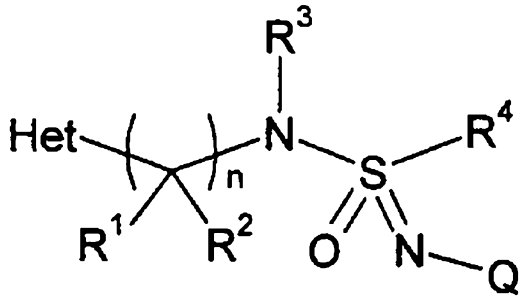
(57)摘要

本發明係關於式(I)之磺醯亞胺基胺(sulfoximinamid)化合物，其對映異構體、非對映體及鹽，及包含該等化合物之組合物。本發明亦關於該等磺醯亞胺基胺化合物、其鹽或包含其之組合物用於對抗動物害蟲之用途。此外，本發明亦關於施用該等磺醯亞胺(sulfoximine)化合物之方法。本發明之磺醯亞胺基胺化合物係由下式Ⅰ定義：



(I) (式Ⅰ)

其中 Q、Het、R^1、R^2、R^3、R^4 及 n 如本說明書中所定義。



(I)

式 (I)

(19)中華民國智慧財產局
(12)發明說明書公開本 (11)公開編號：TW 201012817 A1
(43)公開日： 中華民國 99 (2010) 年 04 月 01 日

(21)申請案號：098120881 (22)申請日： 中華民國 98 (2009) 年 06 月 22 日
(51)Int. Cl.： *C07D417/06 (2006.01)* *A01N43/80 (2006.01)*
A01N43/40 (2006.01) *A01P5/00 (2006.01)*
A01P7/04 (2006.01)
(30)優先權：2008/06/23 美國 61/074,822
(71)申請人：巴地斯顏料化工廠 (德國) BASF SE (DE)
德國
(72)發明人：保林那 羅芙 PAULINI, RALPH (DE)；伯紐寧爵 達芬 BREUNINGER, DELPHINE (FR)；凡 迪恩 沃夫崗 VON DEYN, WOLFGANG (DE)；巴斯提恩斯 亨利克斯 瑪利亞 馬提納斯 BASTIAANS, HENRICUS MARIA MARTINUS (NL)；貝爾 卡斯登 BEYER, CARSTEN (DE)；安斯波 道格拉斯D ANSPAUGH, DOUGLAS D. (US)；歐羅梅 薩德基 哈珊 OLOUMI-SADEGHI, HASSAN (US)
(74)代理人：陳長文
申請實體審查：無 申請專利範圍項數：27 項 圖式數：0 共 188 頁

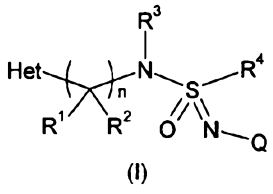
(54)名稱

對抗動物害蟲之磺醯亞胺基胺（ＳＵＬＦＯＸＩＭＩＮＡＭＩＤＥ）化合物

SULFOXIMINAMIDE COMPOUNDS FOR COMBATING ANIMAL PESTS

(57)摘要

本發明係關於式(I)之磺醯亞胺基胺(sulfoximinamid)化合物，其對映異構體、非對映體及鹽，及包含該等化合物之組合物。本發明亦關於該等磺醯亞胺基胺化合物、其鹽或包含其之組合物用於對抗動物害蟲之用途。此外，本發明亦關於施用該等磺醯亞胺(sulfoximine)化合物之方法。本發明之磺醯亞胺基胺化合物係由下式Ⅰ定義：



(I) (式Ⅰ)

其中 Q、Het、R^1、R^2、R^3、R^4 及 n 如本說明書中所定義。

六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於磺醯亞胺基胺(sulfoximinamid)化合物，其對映異構體、非對映體及鹽，及包含該等化合物之組合物。本發明亦係關於該等磺醯亞胺基胺化合物、其鹽或包含其之組合物用於對抗動物害蟲之用途。此外，本發明亦關於施用該等化合物之方法。

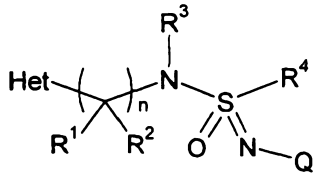
【先前技術】

動物害蟲破壞生長中及已收穫之作物且侵襲木製房屋及商用建築物，從而對食物來源及財產造成大量經濟損失。雖然眾多殺蟲劑為已知的，但由於目標害蟲形成對該等藥劑之抗性的能力，所以對用於對抗動物害蟲之新穎藥劑存在持續需要。詳言之，諸如昆蟲及粉蟎之動物害蟲難以有效控制。

【發明內容】

因此，本發明之一目的在於提供具有良好殺蟲活性、尤其針對難以控制之昆蟲及粉蟎之殺蟲活性的化合物。

已發現此等目的係由通式I之磺醯亞胺基胺衍生物達成：



(I)，

其中：

Q為NO_2或CN；

n為0、1或2；

R^1及R^2係彼此獨立地且與n無關地選自氫、鹵素、C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6烷氧基、CN、NO_2、$C(O)R^c$、$C(O)OR^a$、$C(O)NR^aR^b$、$C(S)NR^aR^b$或$S(O)_mR^c$，且其中：

上述基團中之碳原子可帶有1個、2個或3個基團R^d之任何組合；

或

R^1及R^2連同其所連接之碳原子一起形成3員至6員碳環，且其中該環之碳原子可帶有1或2個基團R^d之任何組合；

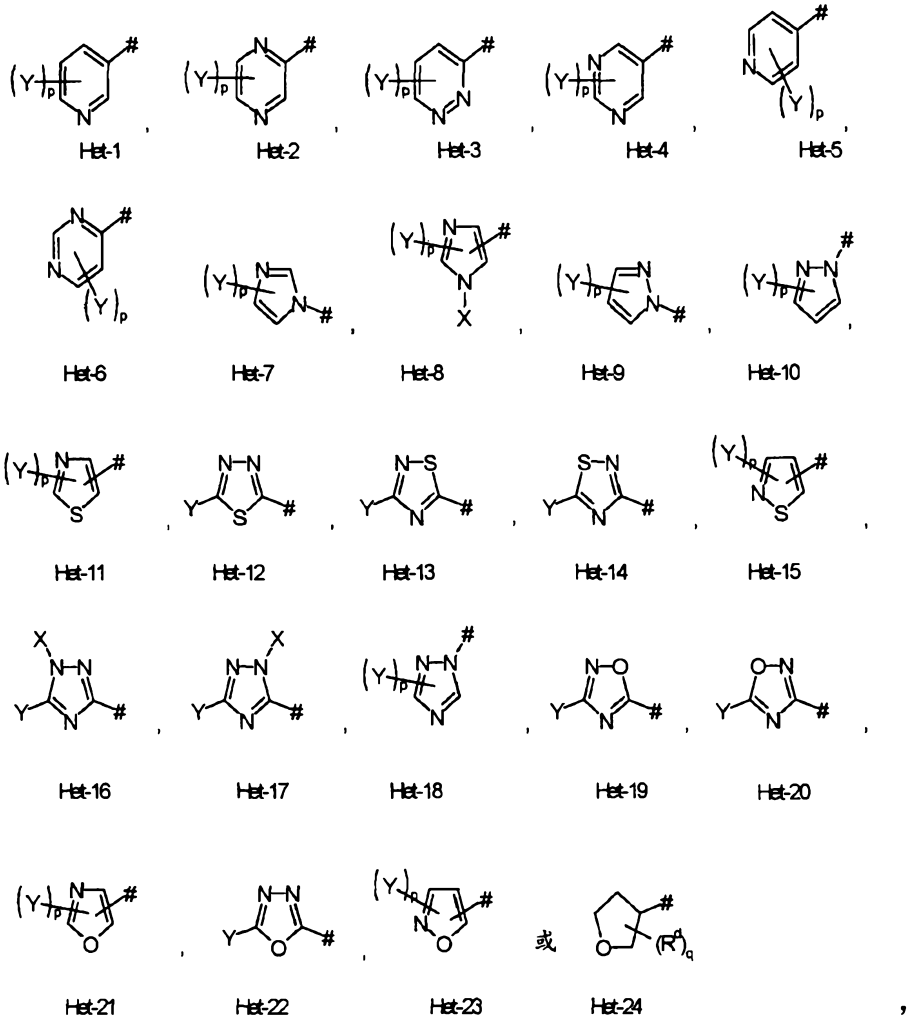
R^3係選自氫、C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6烷氧基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、$C(O)R^c$、$C(O)OR^a$、$C(O)NR^aR^b$、$C(S)NR^aR^b$、SO_mR^c或NR^e，且其中上述基團中之碳原子可帶有1個、2個或3個基團R^d之任何組合；

R^4係選自C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基或NR^eR^f，且其中上述基團中之碳原子可帶有1個、2個或3個基團R^d之任何組合；

或

R^3及R^4連同其所鍵結之氮及硫原子一起形成視情況含有選自N、O、S之額外雜原子的飽和或不飽和4員、5員或6員雜環，而該雜環之碳原子可視情況帶有1或2個基團R^d之任何組合且而該額外N原子視情況可帶有R^e；

Het係選自：



其中#表示式(I)中之鍵，且

X係選自氫、C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵烷基、C_3-C_6環烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6鹵烯基、C_2-C_6炔基、C_2-C_6鹵炔基、$C(O)R^c$、$C(O)OR^5$、$C(O)NR^aR^b$、$C(S)NR^aR^b$或$S(O)_mR^c$，且其中上述基團中之碳原子可帶有1個、2個或3個基團R^d之任何組合；

Y係選自鹵素、C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6烷氧基、CN、NO_2、$S(O)_mR^c$、$C(O)R^c$、$C(O)OR^a$、$C(O)NR^aR^b$或$C(S)NR^aR^b$，且其中上述基團中之

碳原子可帶有1個、2個或3個基團R^d之任何組合；

p為0、1或2；

q為0、1或2；

且其中：

R^a、R^b係彼此獨立地選自氫、C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基、C_3-C_6環烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6鹵烯基或C_3-C_6炔基；

R^c係選自C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基、C_3-C_6環烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6鹵烯基或C_2-C_6炔基；

R^d係選自鹵素、C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基、C_3-C_6環烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6鹵烯基或C_2-C_6炔基、C_1-C_6烷氧基、C_2-C_6烯氧基、C_2-C_6炔氧基、C_1-C_6鹵烷氧基或C_1-C_6烷硫基；

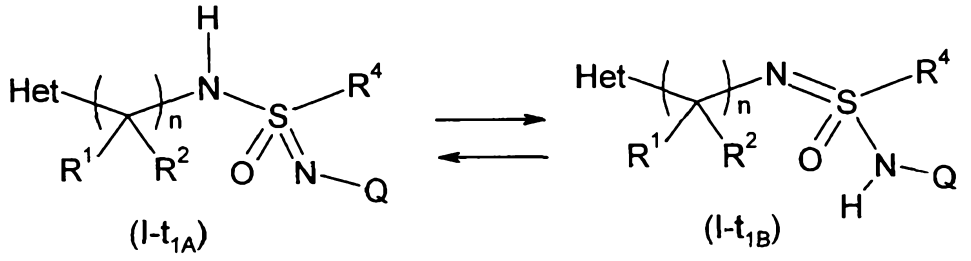
R^e、R^f係彼此獨立地選自氫、C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基、C_3-C_6環烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6鹵烯基、C_3-C_6炔基、$C(O)R^c$、$C(O)OR^a$、$C(O)NR^aR^b$或$C(S)NR^aR^b$；

m為0、1或2；

或其農業上或獸醫學上可接受之鹽、對映異構體或非對映體。

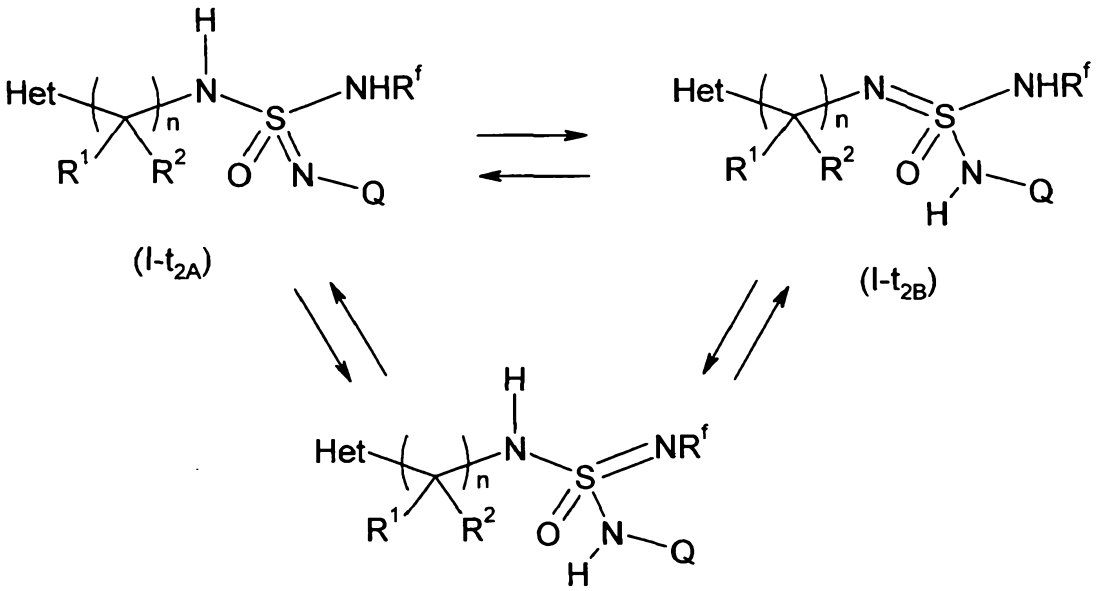
視取代型而定，式I化合物可含有一或多個對掌性中心，在該狀況下，其以對映異構體或非對映體混合物之形式存在。本發明之主題不僅為含有此等混合物之組合物，而且為含有純對映異構體或非對映體之組合物。

本發明之化合物(I)亦可表示不同互變異構結構。舉例而言，若R^3為氫，則表示以下兩種互變異構結構：



(I-t_{1A}) (I-t_{1B}) ;

若R^3為氫且R^4為NR^eR^f，且R^e或R^f中之一者為氫，則以下互變異構結構更為可能：



(I-t_{2A}) (I-t_{2B}) (I-t_{2C}) 。

本發明之式I化合物亦可以不同結晶變體之形式存在，該等結晶變體之生物活性可不同。此等結晶變體亦為本發明之主題。

除草性磺醯亞胺醯胺(sulfonimidamide)化合物已描述於EP173498中。其他一般磺醯亞胺(sulfoximine)化合物(諸如芳基磺醯亞胺化合物)已在GB 1307271中描述為除草劑及殺蟲劑。磺醯亞胺化合物之吡唑、吡咯及咪唑衍生物及其殺蟲活性可見於WO 9639389中。磺醯亞胺化合物之異噁

唑啉衍生物及其除草活性已論述於WO 2006037945中。經烷基取代之磺醯亞胺化合物之殺昆蟲活性可見於WO 2006060029中。

式I之磺醯亞胺基胺化合物及其農業上可接受之鹽對動物害蟲，亦即有害節肢動物及線蟲，尤其對難以控制之昆蟲及粉蟎具高度活性。

因此，本發明係關於通式I之磺醯亞胺基胺化合物、其農業上或獸醫學上適用之鹽、其對映異構體或非對映體。

此外，本發明係關於：

- 包含一定量之至少一種式I化合物或其對映異構體、非對映體或鹽之農業及獸醫學組合物；
- 式I化合物或其對映異構體、非對映體或鹽對抗動物害蟲之用途；
- 一種對抗動物害蟲之方法，其包含使動物害蟲，其棲息地，滋生地，食物來源，動物害蟲生長或可能生長之植物、種子、土壤、區域、材料或環境，或欲保護以免遭動物侵襲或侵染之材料、植物、種子、土壤、表面或空間與殺蟲有效量之至少一種式I化合物或其對映異構體、非對映體或鹽接觸；
- 一種保護作物免遭動物害蟲侵襲或侵染之方法，其包含使作物與殺蟲有效量之至少一種式I化合物或其對映異構體、非對映體或鹽接觸；
- 一種保護種子免遭土壤昆蟲侵害及保護幼苗之根及嫩芽免遭土壤及葉片昆蟲侵害之方法，其包含使種子在播種

前及/或催芽後與至少一種式I化合物或其對映異構體、非對映體或鹽接觸；

- 包含式I化合物或其對映異構體、非對映體或鹽之種子；
- 式I化合物或其對映異構體、非對映體或獸醫學上可接受之鹽對抗動物體內及體表之寄生蟲的用途；
- 一種治療、控制、預防或保護動物免遭寄生蟲侵染或感染之方法，其包含向動物經口、局部或非經腸投與或施用殺寄生蟲有效量之式I化合物或其對映異構體、非對映體及/或獸醫學上可接受之鹽；
- 一種製備用於治療、控制、預防或保護動物免遭寄生蟲侵染或感染之組合物的方法，該組合物包含殺寄生蟲有效量之式I化合物或其對映異構體、非對映體及/或獸醫學上可接受之鹽。

式I化合物之鹽較佳為農業上及/或獸醫學上可接受之鹽。其可以習用方法形成，例如，若式I化合物具有鹼性官能基，則藉由使該化合物與所述陰離子之酸反應；或藉由使式I之酸性化合物與適合鹼反應。

合適之農業上或獸醫學上適用之鹽尤其為彼等陽離子之鹽或彼等酸之酸加成鹽，該等鹽之陽離子及陰離子分別對本發明之化合物的作用無任何不利影響。合適之陽離子尤其為鹼金屬離子，較佳為鋰、鈉及鉀離子；鹼土金屬離子，較佳為鈣、鎂及鋇離子；及過渡金屬離子，較佳為錳、銅、鋅及鐵離子；以及銨(NH_4^+)與經取代之銨，其中氫原子中之1至4者經C_1-C_4烷基、C_1-C_4羥烷基、C_1-C_4烷氧

基、C_1-C_4烷氧基-C_1-C_4烷基、羥基-C_1-C_4烷氧基-C_1-C_4烷基、苯基或苯甲基置換。經取代之銨離子之實例包含甲銨、異丙銨、二甲銨、二異丙銨、三甲銨、四甲銨、四乙銨、四丁銨、2-羥乙基銨、2-(2-羥基乙氧基)乙基銨、雙(2-羥乙基)銨、苯甲基三甲基銨及苯甲基三乙基銨，此外鏻離子，銃離子，較佳為三(C_1-C_4烷基)銃，及氧銃(sulfoxonium)離子，較佳為三(C_1-C_4烷基)氧銃。

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

在變數之上述定義中所提及之有機部分(如術語鹵素)為個別基團成員之個別清單的集合術語。字首C_n-C_m表示在各種狀況下基團中可能之碳原子數。

「鹵素」將用於意謂氟基、氯基、溴基及碘基。

術語「部分或完全鹵化」將用於意謂給定基團之1個或1個以上(例如1個、2個、3個、4個或5個或所有)氫原子已經鹵素原子、尤其經氟或氯置換。

如本文中(以及C_n-C_m烷基胺基、二C_n-C_m烷基胺基、C_n-C_m烷基胺基羰基、二(C_n-C_m烷基胺基)羰基、C_n-C_m烷硫基、C_n-C_m烷基亞磺醯基及C_n-C_m烷基磺醯基中)所用之術語

「C_n-C_m烷基」係指具有n至m個碳原子(例如1至10個碳原子，較佳1至6個碳原子)之分支鏈或未分支鏈飽和烴基，例如甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基、1-乙基-2-甲基丙基、庚基、辛基、2-乙基己基、壬基及癸基及其異構體。C_1-C_4烷基意謂(例如)甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基或1,1-二甲基乙基。

如本文中(以及C_n-C_m鹵烷基亞磺醯基及C_n-C_m鹵烷基磺醯基中)所用之術語「C_n-C_m鹵烷基」係指具有n至m個碳原子(例如1至10個、尤其1至6個碳原子)之直鏈或分支鏈烷基(如上文所提及)，其中此等基團中之一些或所有氫原子可經如上文所提及之鹵素原子置換，例如C_1-C_4鹵烷基，諸如氯甲基、溴甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、1-氯乙基、1-溴乙基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基及其

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

類似地，「C_n-C_m烷氧基」及「C_n-C_m烷硫基」(或C_n-C_m烷基次磺醯基)分別係指在烷基中之任何鍵處分別經由氧鍵或硫鍵鍵結之具有n至m個碳原子(例如1至10個、尤其1至6個或1至4個碳原子)之直鏈或分支鏈烷基(如上文所提及)。實例包括C_1-C_4烷氧基，諸如甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、丁氧基、第二丁氧基、異丁氧基及第三丁氧基；另外C_1-C_4烷硫基，諸如甲硫基、乙硫基、丙硫基、異丙硫基及正丁硫基。

因此，術語「C_n-C_m鹵烷氧基」及「C_n-C_m鹵烷硫基」(或C_n-C_m鹵烷基次磺醯基)分別係指在烷基中之任何鍵處分別經由氧鍵或硫鍵鍵結之具有n至m個碳原子(例如1至10個、尤其1至6個或1至4個碳原子)之直鏈或分支鏈烷基(如上文所提及)，其中此等基團中之一些或所有氫原子可經如上文所提及之鹵素原子置換，例如C_1-C_2鹵烷氧基，諸如氯甲氧基、溴甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、1-氯乙氧基、1-溴乙氧基、1-氟乙氧基、2-氟乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基及五氟乙氧基；另外C_1-C_2鹵烷硫

基，諸如氯甲硫基、溴甲硫基、二氯甲硫基、三氯甲硫基、氟甲硫基、二氟甲硫基、三氟甲硫基、氯氟甲硫基、二氯氟甲硫基、氯二氟甲硫基、1-氯乙硫基、1-溴乙硫基、1-氟乙硫基、2-氟乙硫基、2,2-二氟乙硫基、2,2,2-三氟乙硫基、2-氯-2-氟乙硫基、2-氯-2,2-二氟乙硫基、2,2-二氯-2-氟乙硫基、2,2,2-三氯乙硫基及五氟乙硫基及其類似基團。類似地，術語C_1-C_2氟烷氧基及C_1-C_2氟烷硫基係指分別經由氧原子或硫原子與分子之其餘部分鍵結之C_1-C_2氟烷基。

如本文中所用之術語「C_2-C_m烯基」意謂具有2至m個(例如2至10個或2至6個)碳原子及一處於任何位置之雙鍵的分支鏈或未分支鏈不飽和烴基，諸如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基-乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-1-丁烯基、2-甲基-1-丁烯基、3-甲基-1-丁烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、1,2-二甲基-1-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-1-戊烯基、2-甲基-1-戊烯基、3-甲基-1-戊烯基、4-甲基-1-戊烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-2-戊烯基、4-甲基-2-戊烯基、1-甲基-3-戊烯

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

如本文中所用之術語「C_2-C_m炔基」係指具有2至m個(例如2至10個或2至6個)碳原子且含有至少一個參鍵之分支鏈或未分支鏈不飽和烴基，諸如乙炔基、丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基及其類似基團。

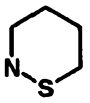
如本文中所用之術語「C_1-C_4烷氧基-C_1-C_4烷基」係指具有1至4個碳原子之烷基(例如，如上文所提及之特定實例)，其中烷基之1個氫原子經C_1-C_4烷氧基置換。

如本文中所用之術語「C_3-C_m環烷基」係指3員至m員單環飽和環脂族基團，例如環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基、環辛基及環癸基。

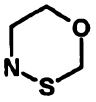
如本文中所用之術語「芳基」係指芳族烴基，諸如萘基或尤其苯基。

如本文中所用之術語「3員至6員碳環」係指環丙烷、環丁烷、環戊烷及環己烷環。

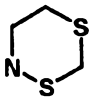
術語「飽和4員、5員或6員雜環」係由以下實例說明：



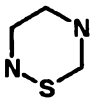
[1,2]硫氮雜環己烷

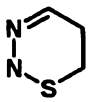


[1,3,4]氧硫氮雜環己烷

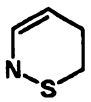


[1,5,2]二硫氮雜環己烷

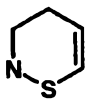




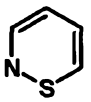
5,6-二氫-2H-[1,2,3]噻二嗪



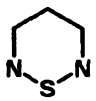
5,6-二氫-2H-[1,2]噻嗪



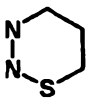
3,4-二氫-2H-[1,2]噻嗪



2H-[1,2]噻嗪



[1,2,6]硫二氮雜環己烷



[1,2,3]硫二氮雜環己烷

本文中之較佳者為[1,2]硫氮雜環己烷化合物。

異噻唑啶

2,5-二氫-異噻唑

2,3-二氫-異噻唑

[1,3,4]噁噻唑啶

[1,2,4]噻二唑啶

[1,4,2]二噻唑啶

2,5-二氫-[1,2,4]噻二唑

2,3-二氫-[1,2,4]噻二唑

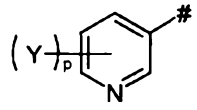
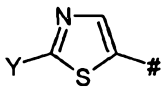
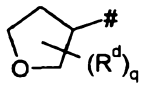
[1,2,5]噻二唑啶

本文中之較佳者為異噻唑啶化合物。

優選

本發明之較佳化合物概述於以下段落中。

本發明之較佳化合物為如下式(I)之磺醯亞胺基胺化合物，其中：

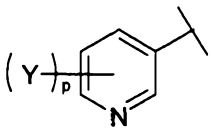
Het係選自  Het-1 ，  Het-11a 或  Het-24 ，且其中Y係選自鹵素、C_1-C_4鹵烷基或C_1-C_4烷基；

p為0、1或2；

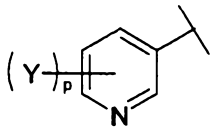
R^d係選自鹵素、C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基、C_3-C_6環烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6鹵烯基或C_2-C_6炔基、C_1-C_6烷氧基、C_2-C_6烯氧基、C_2-C_6炔氧基、C_1-C_6鹵烷氧基或C_1-C_6烷硫基；且

q為0、1或2。

本發明之更佳化合物為如下式(I)之磺醯亞胺基胺化合物，其中：

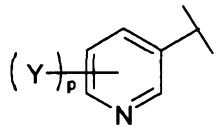
Het為  ，且其中Y係選自鹵素、C_1-C_4鹵烷基或C_1-C_4烷基且p為0、1或2。

本發明之最佳化合物為如下式(I)之磺醯亞胺基胺化合物，其中：

Het為  ，且其中Y係選自鹵素、C_1-C_4鹵烷基

或C_1-C_4烷基且p為1。

尤其較佳者為彼等式(I)之磺醯亞胺基胺化合物，其中：

Het為  ，且其中Y為鹵素或C_1-C_4鹵烷基且p為1。

本發明之較佳化合物為如下式(I)之磺醯亞胺基胺化合物，其中Q為CN。

本發明之較佳化合物為如下式(I)之磺醯亞胺基胺化合物，其中n為0或1。

更佳者為如下式(I)之磺醯亞胺基胺化合物，其中n為0。

本發明之較佳化合物為如下式(I)之磺醯亞胺基胺化合物，其中R^1及R^2係彼此獨立地且與n無關地選自氫、C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基或C_3-C_6環烷基。

本發明之更佳化合物為如下式(I)之磺醯亞胺基胺化合物，其中R^1及R^2係彼此獨立地且與n無關地選自氫、甲基、乙基或三氟甲基。

更佳者亦為如下式(I)之磺醯亞胺基胺化合物，其中R^1及R^2連同其所連接之碳原子一起形成環丙烷。

本發明之較佳化合物為如下式(I)之磺醯亞胺基胺化合物，其中R^3係選自氫、C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6鹵烷基或C_4-C_6環烷基烷基。

本發明之更佳化合物為如下式(I)之磺醯亞胺基胺化合物，其中R^3係選自氫、甲基、乙基、丙基、異丙基、環丙基、第三丁基或環丙基甲基。

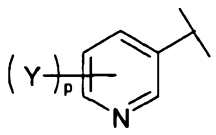
本發明之較佳化合物為如下式(I)之磺醯亞胺基胺化合物，其中R^4係選自C_1-C_4烷基、C_3-C_4環烷基、C_1-C_4鹵烷基或環丙基甲基。

本發明之更佳化合物為如下式(I)之磺醯亞胺基胺化合物，其中R^4為甲基或乙基。

更佳者亦為如下式(I)之磺醯亞胺基胺化合物，其中R^3及R^4連同其所鍵結之氮及硫原子一起形成飽和或不飽和5員或6員雜環，而該雜環之碳原子可視情況帶有1或2個基團R^d之任何組合，且其中R^d係選自鹵素、C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基、C_3-C_6環烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6鹵烯基或C_2-C_6炔基、C_1-C_6烷氧基、C_2-C_6烯氧基、C_2-C_6炔氧基、C_1-C_6鹵烷氧基或C_1-C_6烷硫基。

尤其較佳者為彼等式(I)之磺醯亞胺基胺化合物，其中R^3及R^4連同其所鍵結之氮及硫原子一起形成異噻唑啶或[1,2]硫氮雜環己烷環。

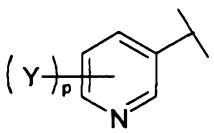
以下段落出於說明之目的展示一些可能的優選組合。任何優選組合皆涵蓋於本發明中。

本發明之尤其較佳化合物為如下式(I)之磺醯亞胺基胺化合物，其中Het為  ，且其中Y係選自鹵素、C_1-C_4鹵烷基或C_1-C_4烷基且p為0、1或2，其中Q為CN，n為0或1，R^1及R^2係彼此獨立地選自氫、甲基、乙基或三氟甲基，或R^1及R^2連同其所連接之碳原子一起形成環丙烷，R^3係選自氫、甲基、乙基、丙基、異丙基、環丙基、第三丁

基或環丙基甲基且R^4為甲基或乙基，或R^3及R^4連同其所鍵結之氮及硫原子一起形成視情況含有選自N、O、S之額外雜原子的飽和或不飽和4員、5員或6員雜環，而該雜環之碳原子可視情況帶有1或2個基團R^d之任何組合且而該額外N原子視情況可帶有R^e，且其中：

R^d係選自鹵素、C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基、C_3-C_6環烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6鹵烯基或C_2-C_6炔基、C_1-C_6烷氧基、C_2-C_6烯氧基、C_2-C_6炔氧基、C_1-C_6鹵烷氧基或C_1-C_6烷硫基，且

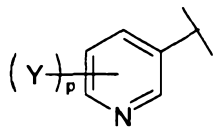
R^e係選自氫、C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基、C_3-C_6環烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6鹵烯基、C_3-C_6炔基、$C(O)R^c$、$C(O)OR^a$、$C(O)NR^aR^b$或$C(S)NR^aR^b$。

本發明之尤其較佳化合物為如下式(I)之磺醯亞胺基胺化合物，其中Het為  ，且其中Y係選自氟基、氯基、溴基、碘基或C_1-C_4鹵烷基且p為1，其中Q為CN，n為0，R^3係選自氫、甲基、乙基、丙基、異丙基、環丙基、第三丁基或環丙基甲基且R^4為甲基或乙基，或R^3及R^4連同其所鍵結之氮及硫原子一起形成視情況含有選自N、O、S之額外雜原子的飽和或不飽和4員、5員或6員雜環，而該雜環之碳原子可視情況帶有1或2個基團R^d之任何組合且而該額外N原子視情況可帶有R^e，且其中：

R^d係選自鹵素、C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基、C_3-C_6環烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6鹵烯基或C_2-C_6炔基、C_1-C_6烷氧

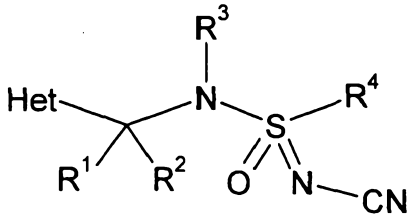
基、C_2-C_6烯氧基、C_2-C_6炔氧基、C_1-C_6鹵烷氧基或C_1-C_6烷硫基，且

R^e係選自氫、C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基、C_3-C_6環烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6鹵烯基、C_3-C_6炔基、$C(O)R^c$、$C(O)OR^a$、$C(O)NR^aR^b$或$C(S)NR^aR^b$。

本發明之尤其較佳化合物為如下式(I)之磺醯亞胺化合物，其中Het為  ，且其中Y係選自鹵素或C_1-C_4鹵烷基且p為1，Q為CN，n為0且R^3及R^4連同其所鍵結之氮及硫原子一起形成未經取代之異噻唑啶或未經取代之[1,2]硫氮雜環己烷環。

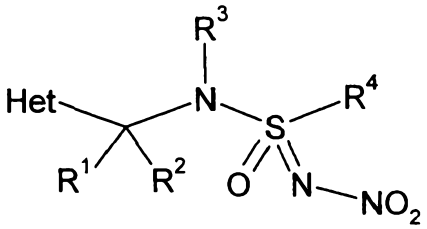
較佳化合物之實例

該等尤其較佳化合物之實例為式(I-A)化合物，其中R^1、R^2、R^3、R^4及Het具有表C.I之第C.1列至C.308列中之任一列所給出之含義。



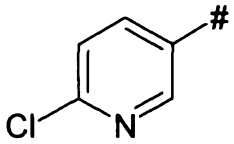
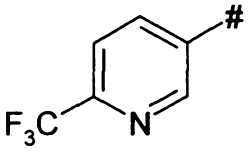
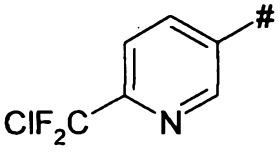
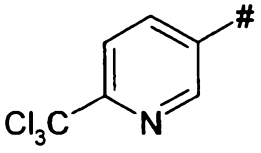
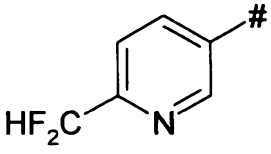
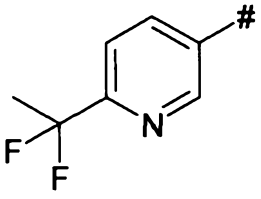
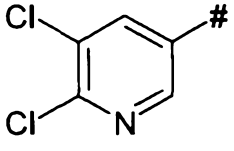
(I-A)

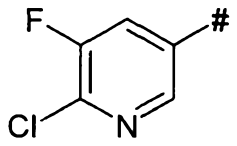
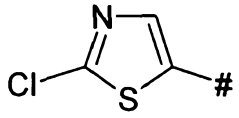
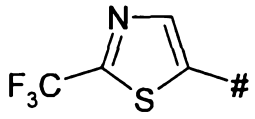
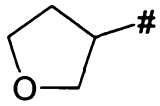
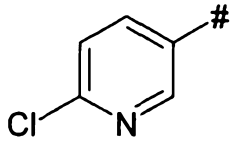
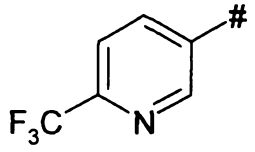
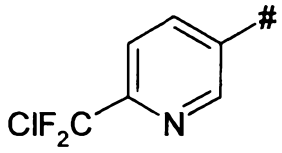
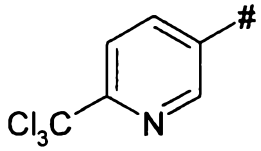
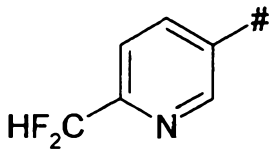
該等尤其較佳化合物之實例亦為式(I-B)化合物，其中R^1、R^2、R^3、R^4及Het具有表C.I之第C.1列至C.308列中之任一列所給出之含義。

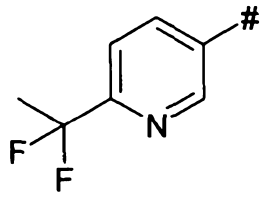
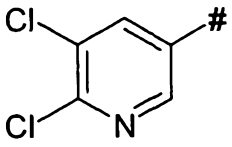
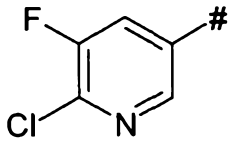
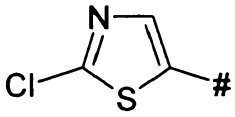
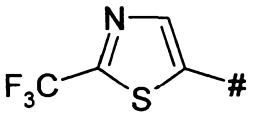
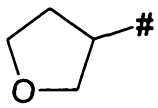
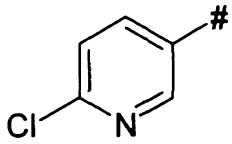
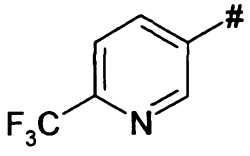
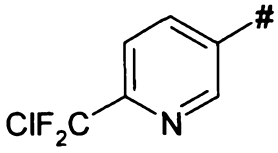


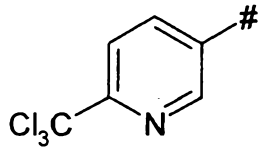
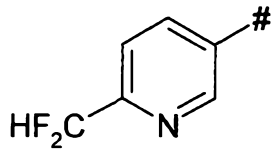
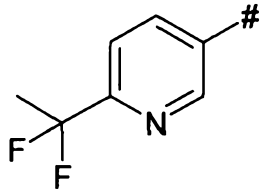
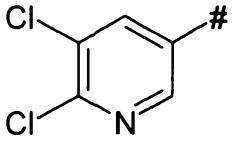
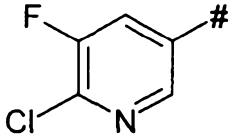
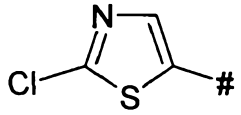
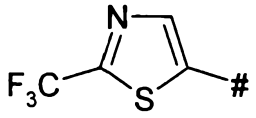
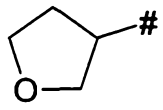
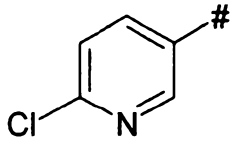
(I-B)

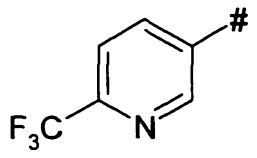
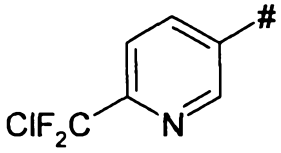
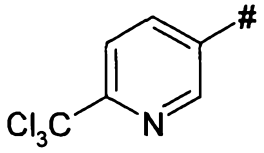
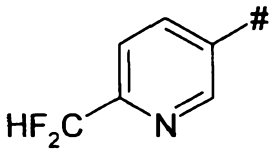
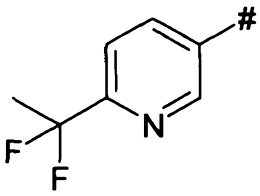
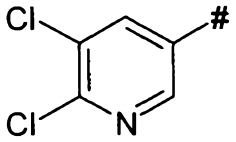
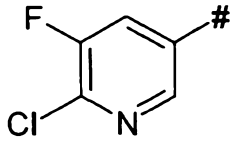
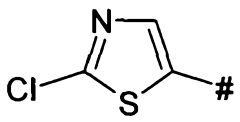
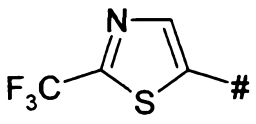
表 C.I：

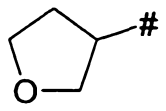
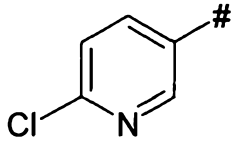
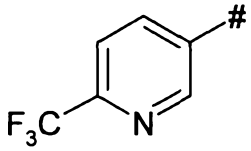
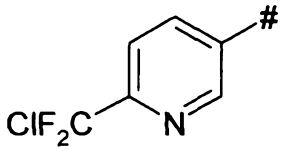
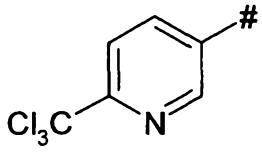
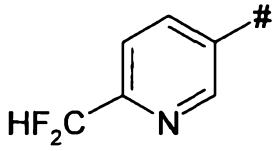
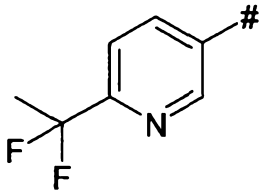
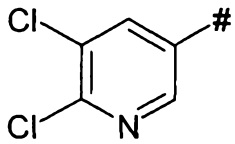
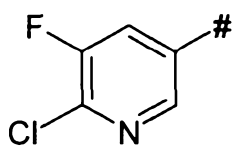
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
1.		H	H	H	CH_3
2.		H	H	H	CH_3
3.		H	H	H	CH_3
4.		H	H	H	CH_3
5.		H	H	H	CH_3
6.		H	H	H	CH_3
7.		H	H	H	CH_3

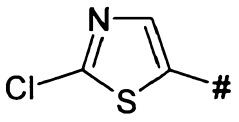
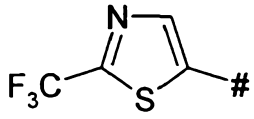
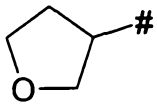
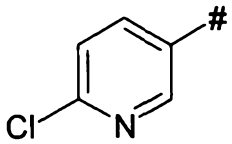
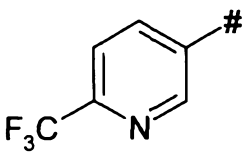
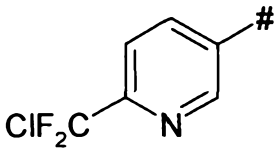
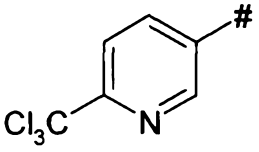
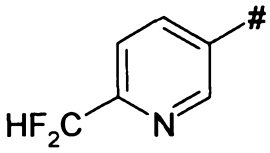
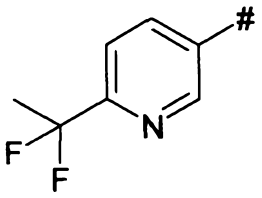
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
8.		H	H	H	CH_3
9.		H	H	H	CH_3
10.		H	H	H	CH_3
11.		H	H	H	CH_3
12.		H	H	H	C_2H_5
13.		H	H	H	C_2H_5
14.		H	H	H	C_2H_5
15.		H	H	H	C_2H_5
16.		H	H	H	C_2H_5

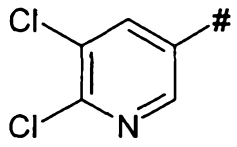
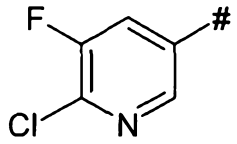
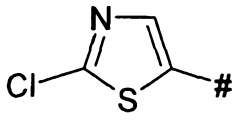
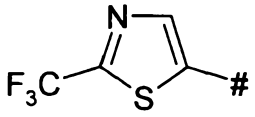
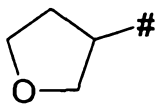
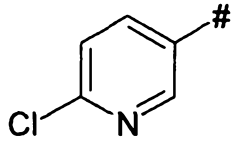
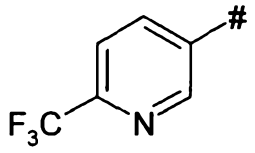
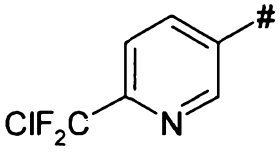
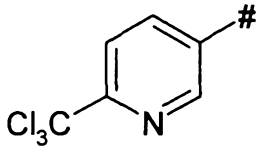
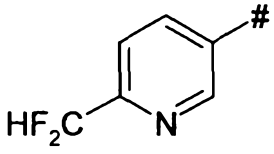
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
17.		H	H	H	C_2H_5
18.		H	H	H	C_2H_5
19.		H	H	H	C_2H_5
20.		H	H	H	C_2H_5
21.		H	H	H	C_2H_5
22.		H	H	H	C_2H_5
23.		H	H	CH_3	CH_3
24.		H	H	CH_3	CH_3
25.		H	H	CH_3	CH_3

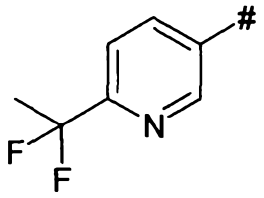
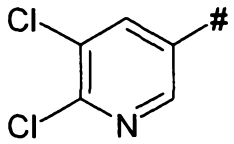
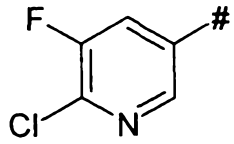
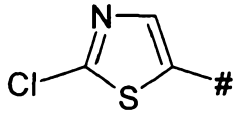
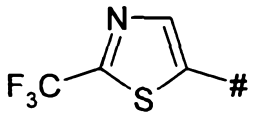
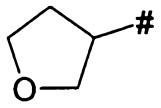
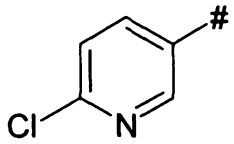
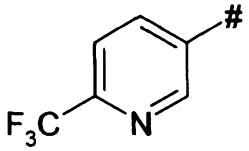
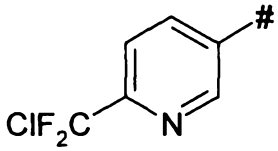
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
26.		H	H	CH_3	CH_3
27.		H	H	CH_3	CH_3
28.		H	H	CH_3	CH_3
29.		H	H	CH_3	CH_3
30.		H	H	CH_3	CH_3
31.		H	H	CH_3	CH_3
32.		H	H	CH_3	CH_3
33.		H	H	CH_3	CH_3
34.		H	H	CH_3	C_2H_5

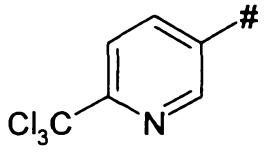
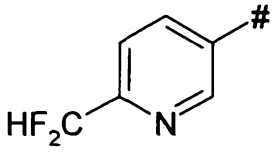
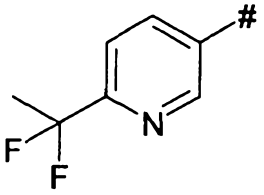
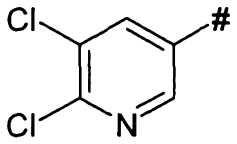
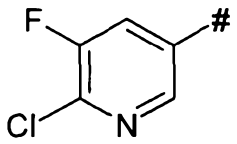
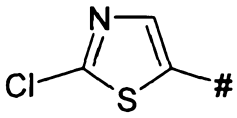
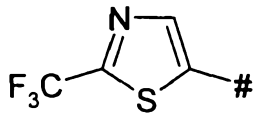
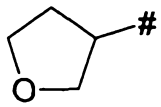
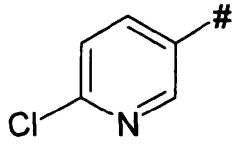
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
35.		H	H	CH_3	C_2H_5
36.		H	H	CH_3	C_2H_5
37.		H	H	CH_3	C_2H_5
38.		H	H	CH_3	C_2H_5
39.		H	H	CH_3	C_2H_5
40.		H	H	CH_3	C_2H_5
41.		H	H	CH_3	C_2H_5
42.		H	H	CH_3	C_2H_5
43.		H	H	CH_3	C_2H_5

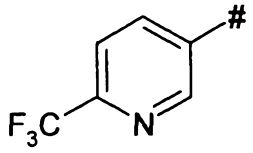
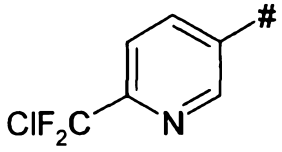
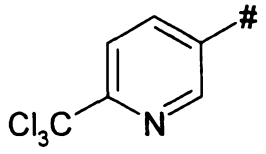
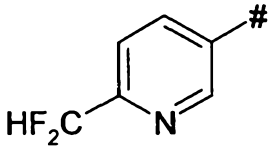
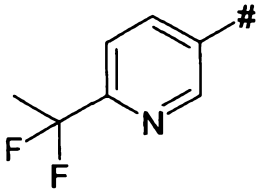
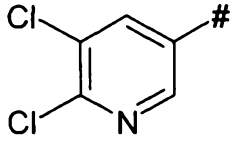
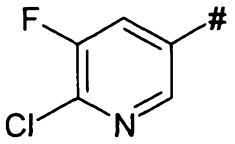
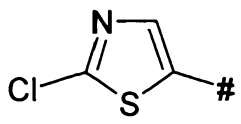
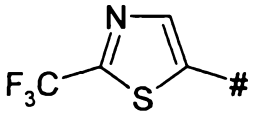
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
44.		H	H	CH_3	C_2H_5
45.		H	H	C_2H_5	CH_3
46.		H	H	C_2H_5	CH_3
47.		H	H	C_2H_5	CH_3
48.		H	H	C_2H_5	CH_3
49.		H	H	C_2H_5	CH_3
50.		H	H	C_2H_5	CH_3
51.		H	H	C_2H_5	CH_3
52.		H	H	C_2H_5	CH_3

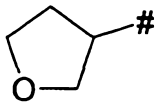
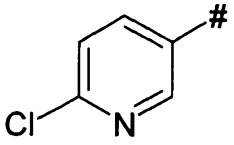
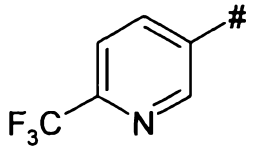
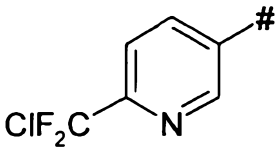
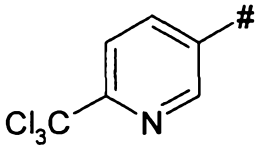
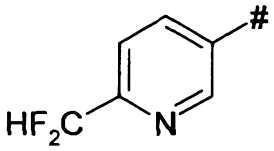
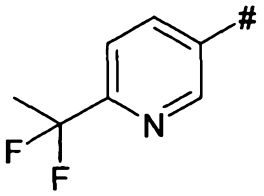
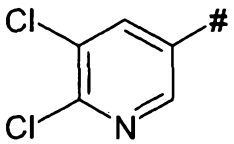
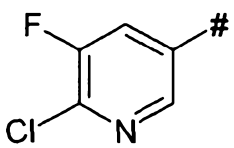
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
53.		H	H	C_2H_5	CH_3
54.		H	H	C_2H_5	CH_3
55.		H	H	C_2H_5	CH_3
56.		H	H	C_2H_5	C_2H_5
57.		H	H	C_2H_5	C_2H_5
58.		H	H	C_2H_5	C_2H_5
59.		H	H	C_2H_5	C_2H_5
60.		H	H	C_2H_5	C_2H_5
61.		H	H	C_2H_5	C_2H_5

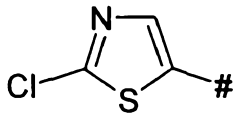
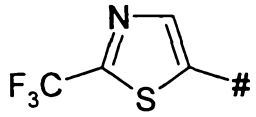
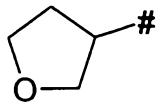
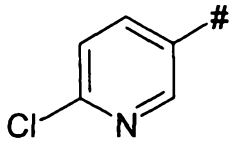
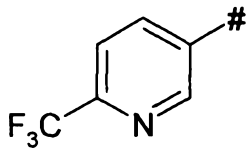
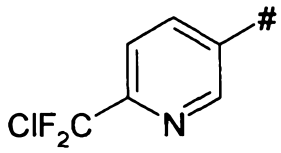
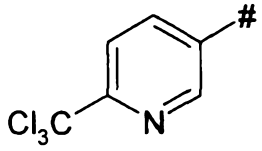
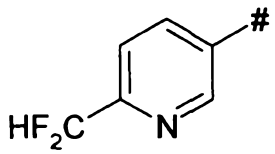
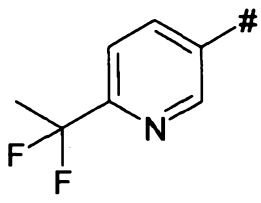
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
62.		H	H	C_2H_5	C_2H_5
63.		H	H	C_2H_5	C_2H_5
64.		H	H	C_2H_5	C_2H_5
65.		H	H	C_2H_5	C_2H_5
66.		H	H	C_2H_5	C_2H_5
67.		H	H	CH_2-CH_2-CH_2	
68.		H	H	CH_2-CH_2-CH_2	
69.		H	H	CH_2-CH_2-CH_2	
70.		H	H	CH_2-CH_2-CH_2	
71.		H	H	CH_2-CH_2-CH_2	

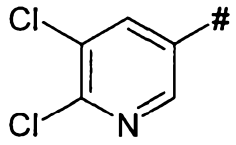
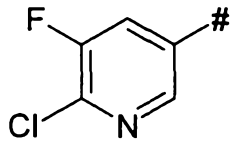
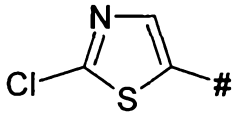
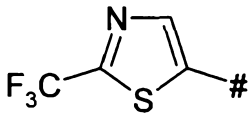
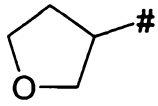
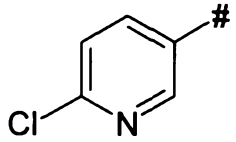
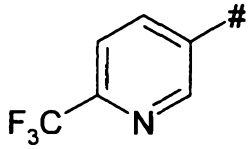
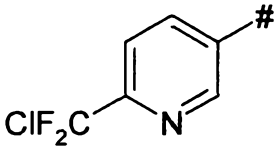
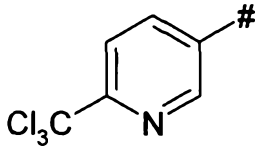
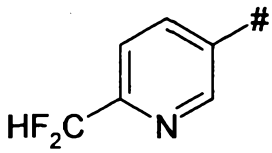
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
72.		H	H	CH_2-CH_2-CH_2	
73.		H	H	CH_2-CH_2-CH_2	
74.		H	H	CH_2-CH_2-CH_2	
75.		H	H	CH_2-CH_2-CH_2	
76.		H	H	CH_2-CH_2-CH_2	
77.		H	H	CH_2-CH_2-CH_2	
78.		H	CH_3	H	CH_3
79.		H	CH_3	H	CH_3
80.		H	CH_3	H	CH_3

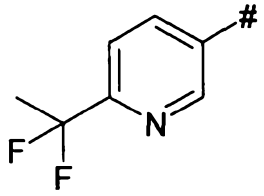
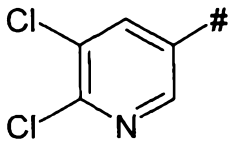
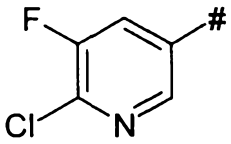
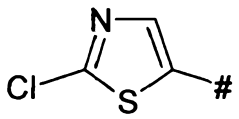
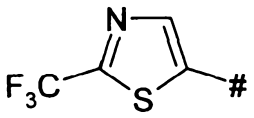
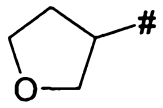
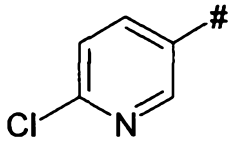
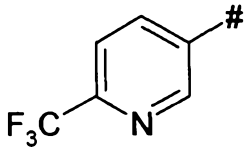
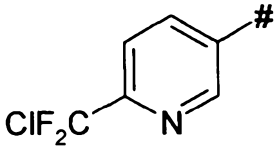
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
81.		H	CH_3	H	CH_3
82.		H	CH_3	H	CH_3
83.		H	CH_3	H	CH_3
84.		H	CH_3	H	CH_3
85.		H	CH_3	H	CH_3
86.		H	CH_3	H	CH_3
87.		H	CH_3	H	CH_3
88.		H	CH_3	H	CH_3
89.		H	CH_3	H	C_2H_5

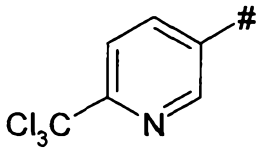
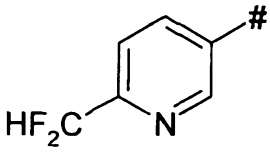
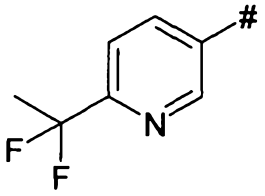
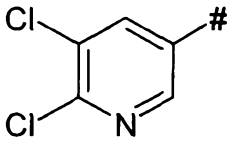
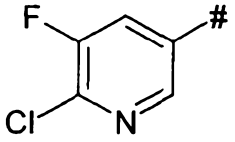
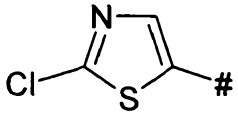
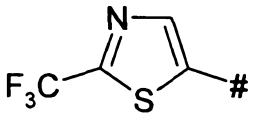
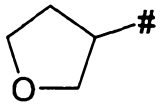
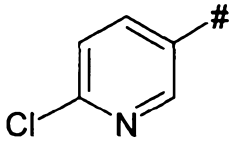
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
90.		H	CH_3	H	C_2H_5
91.		H	CH_3	H	C_2H_5
92.		H	CH_3	H	C_2H_5
93.		H	CH_3	H	C_2H_5
94.		H	CH_3	H	C_2H_5
95.		H	CH_3	H	C_2H_5
96.		H	CH_3	H	C_2H_5
97.		H	CH_3	H	C_2H_5
98.		H	CH_3	H	C_2H_5

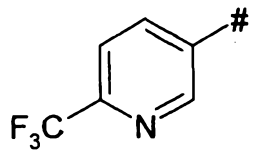
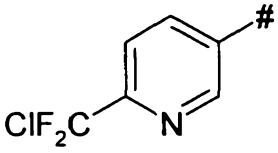
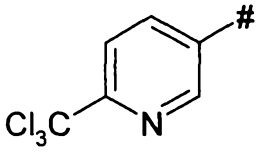
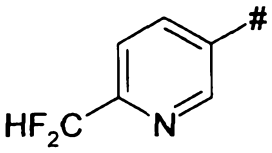
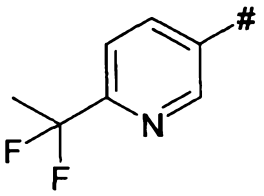
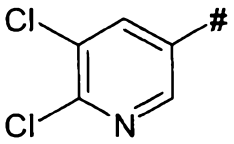
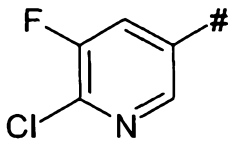
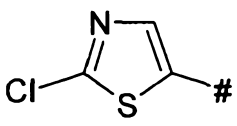
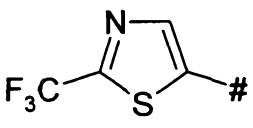
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
99.		H	CH_3	H	C_2H_5
100.		H	CH_3	CH_3	CH_3
101.		H	CH_3	CH_3	CH_3
102.		H	CH_3	CH_3	CH_3
103.		H	CH_3	CH_3	CH_3
104.		H	CH_3	CH_3	CH_3
105.		H	CH_3	CH_3	CH_3
106.		H	CH_3	CH_3	CH_3
107.		H	CH_3	CH_3	CH_3

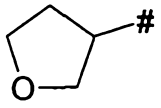
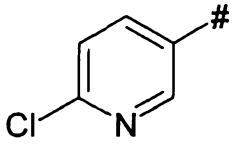
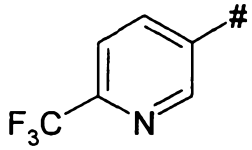
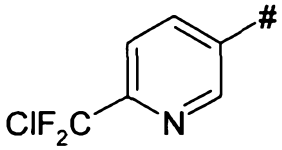
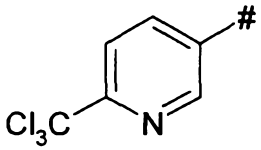
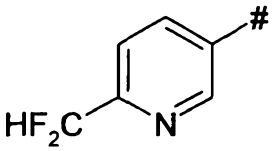
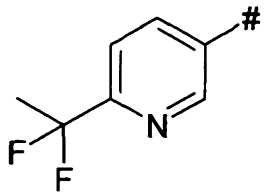
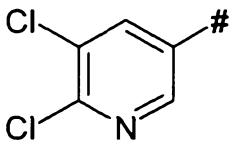
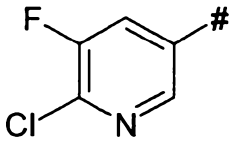
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
108.		H	CH_3	CH_3	CH_3
109.		H	CH_3	CH_3	CH_3
110.		H	CH_3	CH_3	CH_3
111.		H	CH_3	CH_3	C_2H_5
112.		H	CH_3	CH_3	C_2H_5
113.		H	CH_3	CH_3	C_2H_5
114.		H	CH_3	CH_3	C_2H_5
115.		H	CH_3	CH_3	C_2H_5
116.		H	CH_3	CH_3	C_2H_5

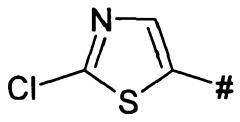
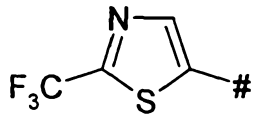
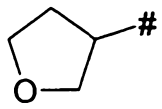
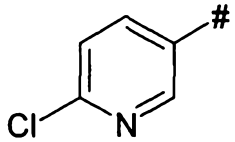
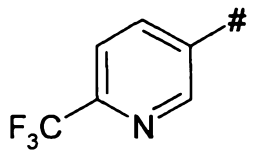
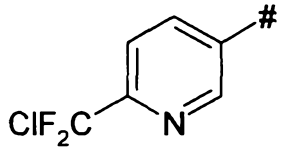
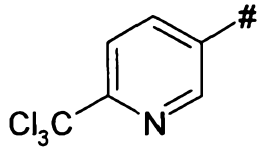
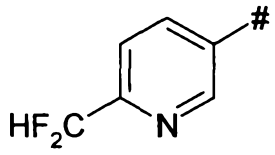
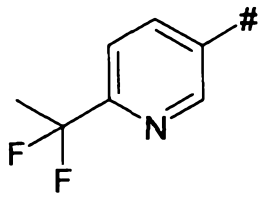
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
117.		H	CH_3	CH_3	C_2H_5
118.		H	CH_3	CH_3	C_2H_5
119.		H	CH_3	CH_3	C_2H_5
120.		H	CH_3	CH_3	C_2H_5
121.		H	CH_3	CH_3	C_2H_5
122.		H	CH_3	C_2H_5	CH_3
123.		H	CH_3	C_2H_5	CH_3
124.		H	CH_3	C_2H_5	CH_3
125.		H	CH_3	C_2H_5	CH_3
126.		H	CH_3	C_2H_5	CH_3

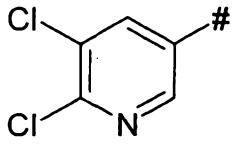
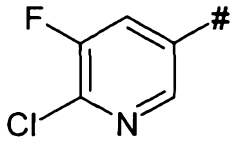
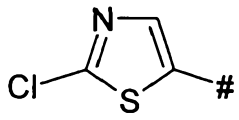
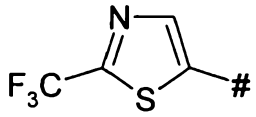
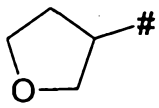
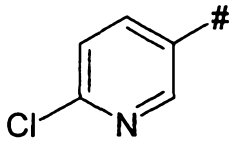
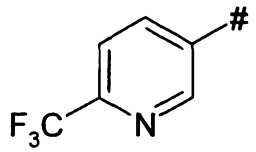
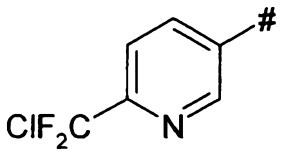
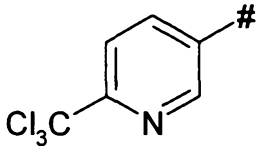
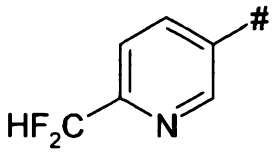
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
127.		H	CH_3	C_2H_5	CH_3
128.		H	CH_3	C_2H_5	CH_3
129.		H	CH_3	C_2H_5	CH_3
130.		H	CH_3	C_2H_5	CH_3
131.		H	CH_3	C_2H_5	CH_3
132.		H	CH_3	C_2H_5	CH_3
133.		H	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
134.		H	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
135.		H	CH_3	C_2H_5	C_2H_5

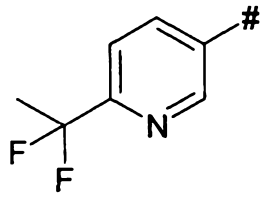
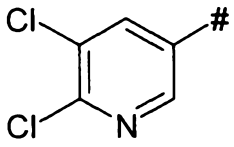
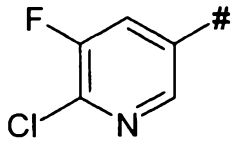
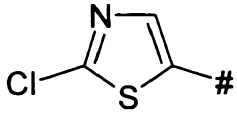
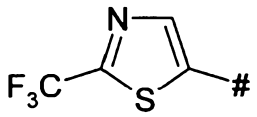
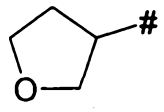
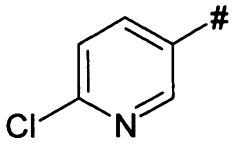
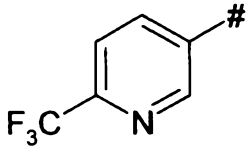
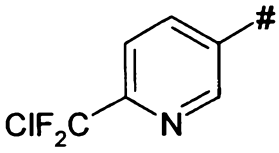
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
136.		H	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
137.		H	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
138.		H	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
139.		H	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
140.		H	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
141.		H	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
142.		H	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
143.		H	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
144.		H	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	

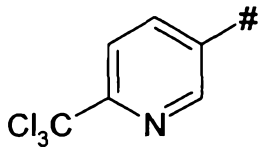
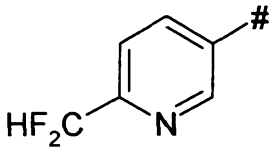
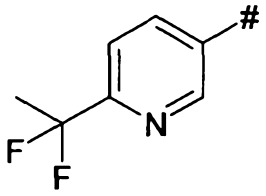
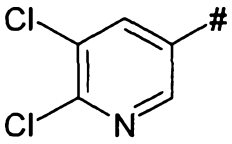
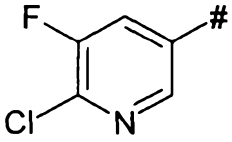
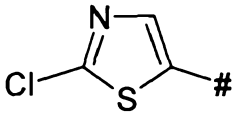
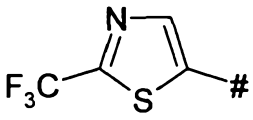
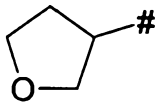
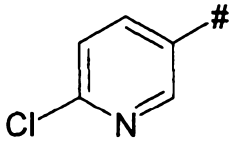
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
145.		H	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	
146.		H	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	
147.		H	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	
148.		H	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	
149.		H	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	
150.		H	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	
151.		H	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	
152.		H	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	
153.		H	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	

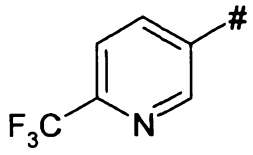
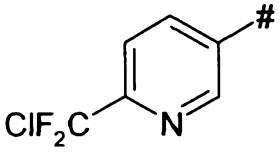
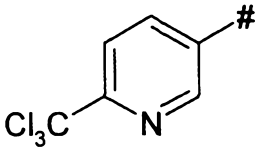
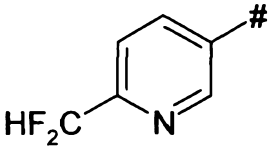
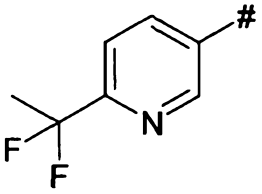
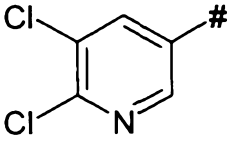
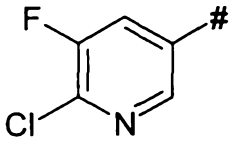
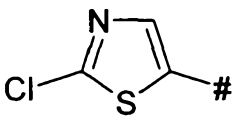
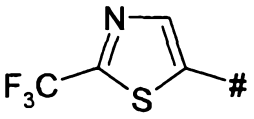
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
154.		H	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	
155.		CH_2-CH_2		H	CH_3
156.		CH_2-CH_2		H	CH_3
157.		CH_2-CH_2		H	CH_3
158.		CH_2-CH_2		H	CH_3
159.		CH_2-CH_2		H	CH_3
160.		CH_2-CH_2		H	CH_3
161.		CH_2-CH_2		H	CH_3
162.		CH_2-CH_2		H	CH_3

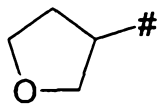
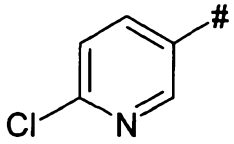
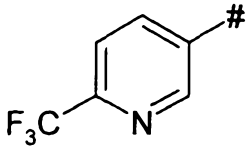
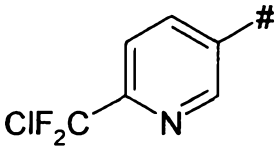
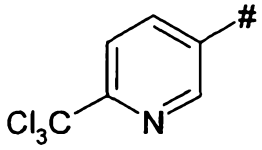
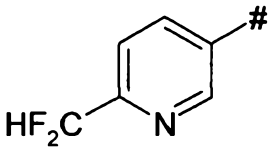
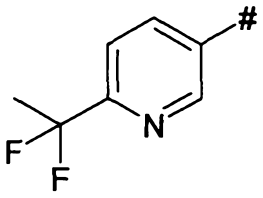
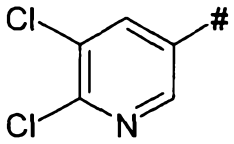
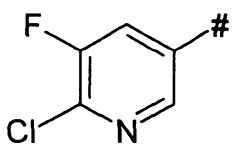
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
163.		CH_2-CH_2		H	CH_3
164.		CH_2-CH_2		H	CH_3
165.		CH_2-CH_2		H	CH_3
166.		CH_2-CH_2		H	C_2H_5
167.		CH_2-CH_2		H	C_2H_5
168.		CH_2-CH_2		H	C_2H_5
169.		CH_2-CH_2		H	C_2H_5
170.		CH_2-CH_2		H	C_2H_5
171.		CH_2-CH_2		H	C_2H_5

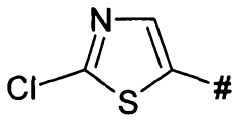
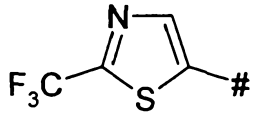
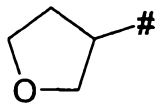
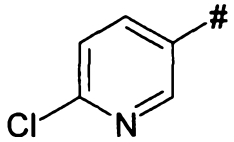
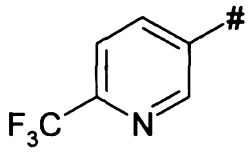
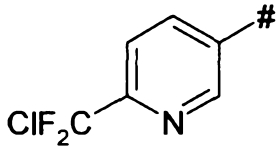
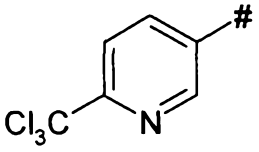
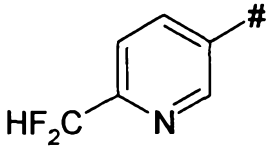
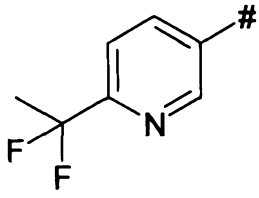
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
172.		CH_2-CH_2		H	C_2H_5
173.		CH_2-CH_2		H	C_2H_5
174.		CH_2-CH_2		H	C_2H_5
175.		CH_2-CH_2		H	C_2H_5
176.		CH_2-CH_2		H	C_2H_5
177.		CH_2-CH_2		CH_3	CH_3
178.		CH_2-CH_2		CH_3	CH_3
179.		CH_2-CH_2		CH_3	CH_3
180.		CH_2-CH_2		CH_3	CH_3
181.		CH_2-CH_2		CH_3	CH_3

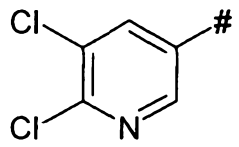
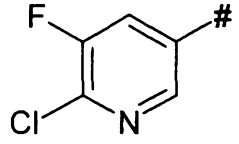
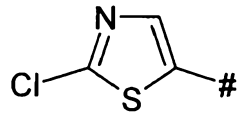
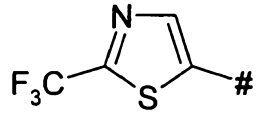
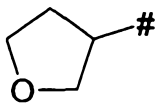
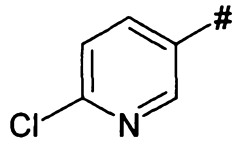
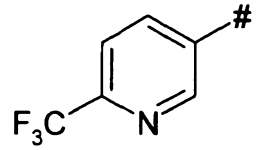
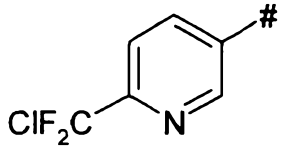
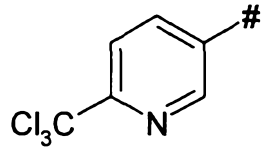
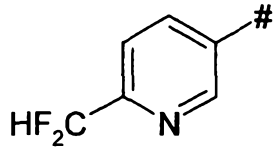
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
182.		CH_2-CH_2		CH_3	CH_3
183.		CH_2-CH_2		CH_3	CH_3
184.		CH_2-CH_2		CH_3	CH_3
185.		CH_2-CH_2		CH_3	CH_3
186.		CH_2-CH_2		CH_3	CH_3
187.		CH_2-CH_2		CH_3	CH_3
188.		CH_2-CH_2		CH_3	C_2H_5
189.		CH_2-CH_2		CH_3	C_2H_5
190.		CH_2-CH_2		CH_3	C_2H_5

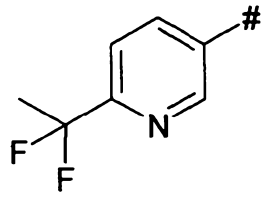
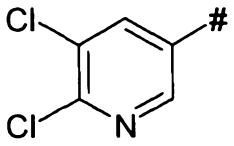
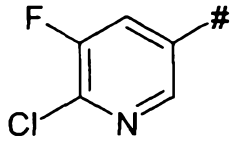
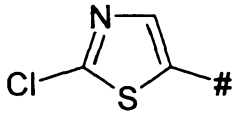
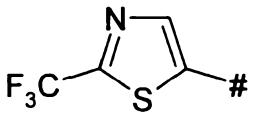
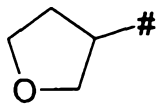
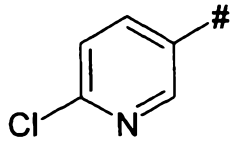
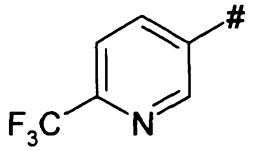
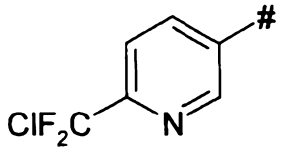
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
191.		CH_2-CH_2		CH_3	C_2H_5
192.		CH_2-CH_2		CH_3	C_2H_5
193.		CH_2-CH_2		CH_3	C_2H_5
194.		CH_2-CH_2		CH_3	C_2H_5
195.		CH_2-CH_2		CH_3	C_2H_5
196.		CH_2-CH_2		CH_3	C_2H_5
197.		CH_2-CH_2		CH_3	C_2H_5
198.		CH_2-CH_2		CH_3	C_2H_5
199.		CH_2-CH_2		C_2H_5	CH_3

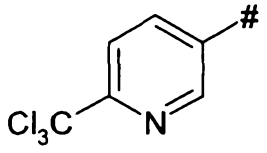
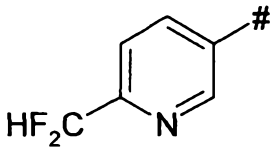
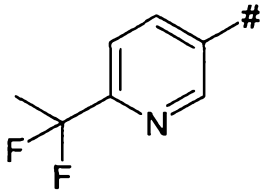
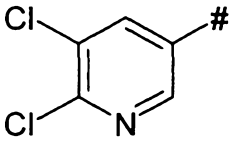
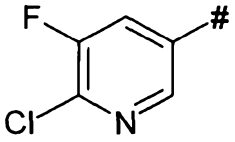
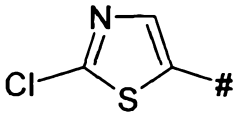
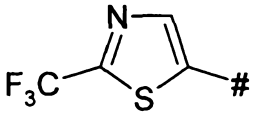
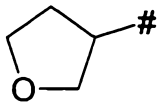
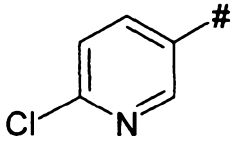
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
200.		CH_2-CH_2		C_2H_5	CH_3
201.		CH_2-CH_2		C_2H_5	CH_3
202.		CH_2-CH_2		C_2H_5	CH_3
203.		CH_2-CH_2		C_2H_5	CH_3
204.		CH_2-CH_2		C_2H_5	CH_3
205.		CH_2-CH_2		C_2H_5	CH_3
206.		CH_2-CH_2		C_2H_5	CH_3
207.		CH_2-CH_2		C_2H_5	CH_3
208.		CH_2-CH_2		C_2H_5	CH_3

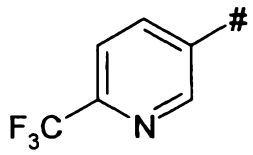
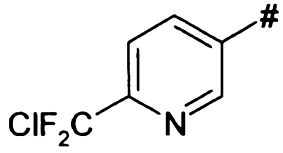
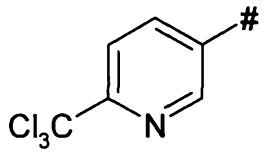
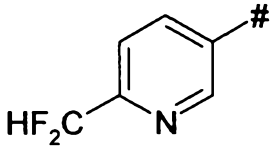
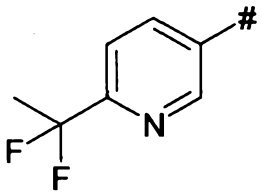
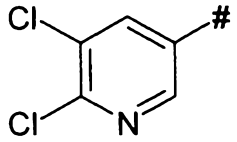
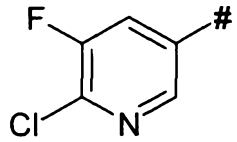
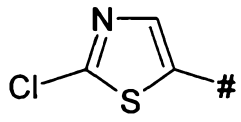
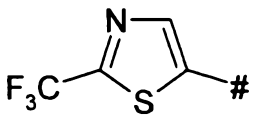
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
209.		CH_2-CH_2		C_2H_5	CH_3
210.		CH_2-CH_2		C_2H_5	C_2H_5
211.		CH_2-CH_2		C_2H_5	C_2H_5
212.		CH_2-CH_2		C_2H_5	C_2H_5
213.		CH_2-CH_2		C_2H_5	C_2H_5
214.		CH_2-CH_2		C_2H_5	C_2H_5
215.		CH_2-CH_2		C_2H_5	C_2H_5
216.		CH_2-CH_2		C_2H_5	C_2H_5
217.		CH_2-CH_2		C_2H_5	C_2H_5

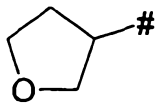
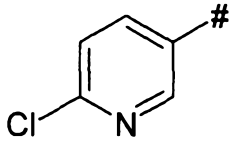
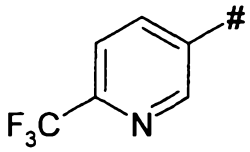
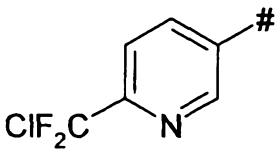
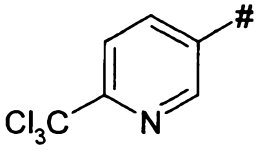
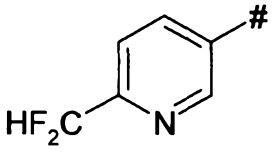
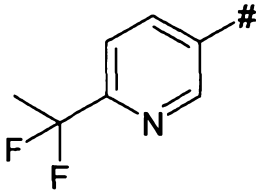
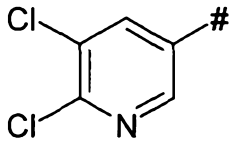
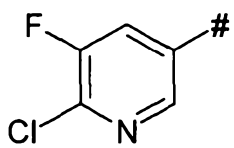
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
218.		CH_2-CH_2		C_2H_5	C_2H_5
219.		CH_2-CH_2		C_2H_5	C_2H_5
220.		CH_2-CH_2		C_2H_5	C_2H_5
221.		CH_2-CH_2		CH_2-CH_2-CH_2	
222.		CH_2-CH_2		CH_2-CH_2-CH_2	
223.		CH_2-CH_2		CH_2-CH_2-CH_2	
224.		CH_2-CH_2		CH_2-CH_2-CH_2	
225.		CH_2-CH_2		CH_2-CH_2-CH_2	
226.		CH_2-CH_2		CH_2-CH_2-CH_2	

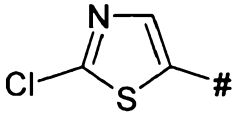
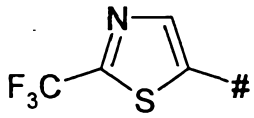
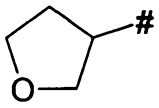
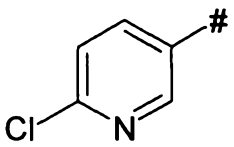
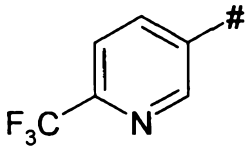
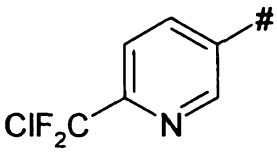
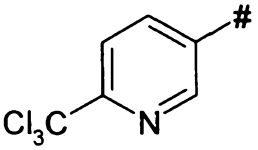
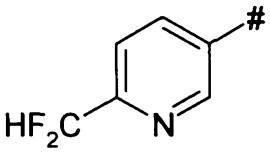
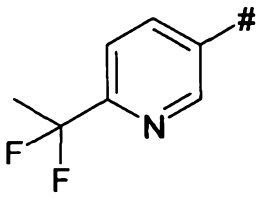
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
227.		CH_2-CH_2		CH_2-CH_2-CH_2	
228.		CH_2-CH_2		CH_2-CH_2-CH_2	
229.		CH_2-CH_2		CH_2-CH_2-CH_2	
230.		CH_2-CH_2		CH_2-CH_2-CH_2	
231.		CH_2-CH_2		CH_2-CH_2-CH_2	
232.		CH_3	CH_3	H	CH_3
233.		CH_3	CH_3	H	CH_3
234.		CH_3	CH_3	H	CH_3
235.		CH_3	CH_3	H	CH_3
236.		CH_3	CH_3	H	CH_3

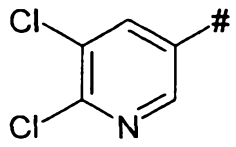
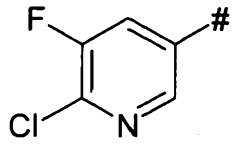
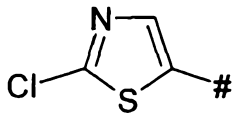
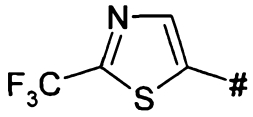
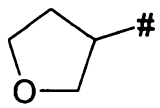
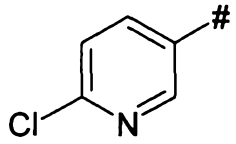
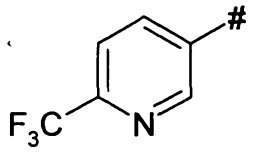
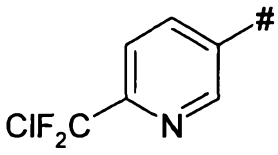
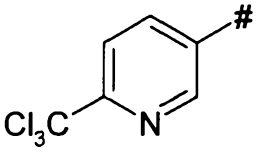
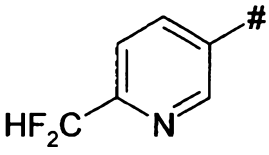
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
237.		CH_3	CH_3	H	CH_3
238.		CH_3	CH_3	H	CH_3
239.		CH_3	CH_3	H	CH_3
240.		CH_3	CH_3	H	CH_3
241.		CH_3	CH_3	H	CH_3
242.		CH_3	CH_3	H	CH_3
243.		CH_3	CH_3	H	C_2H_5
244.		CH_3	CH_3	H	C_2H_5
245.		CH_3	CH_3	H	C_2H_5

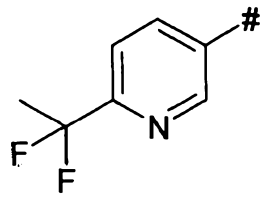
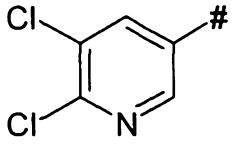
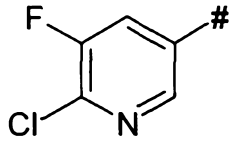
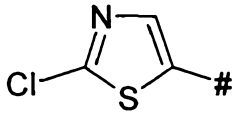
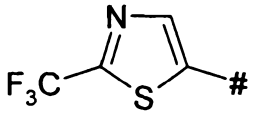
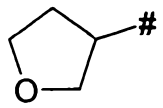
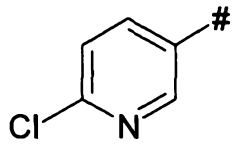
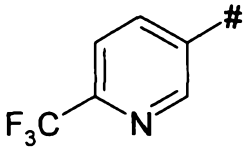
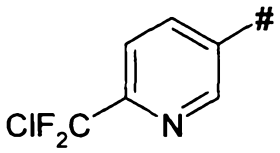
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
246.		CH_3	CH_3	H	C_2H_5
247.		CH_3	CH_3	H	C_2H_5
248.		CH_3	CH_3	H	C_2H_5
249.		CH_3	CH_3	H	C_2H_5
250.		CH_3	CH_3	H	C_2H_5
251.		CH_3	CH_3	H	C_2H_5
252.		CH_3	CH_3	H	C_2H_5
253.		CH_3	CH_3	H	C_2H_5
254.		CH_3	CH_3	CH_3	CH_3

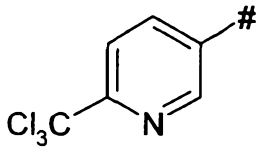
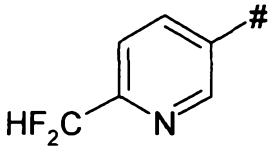
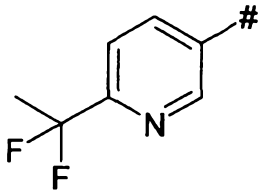
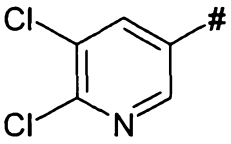
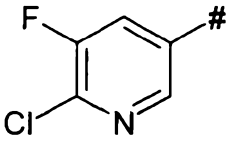
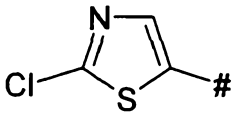
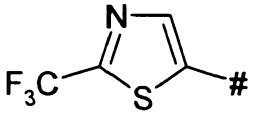
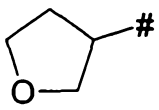
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
255.		CH_3	CH_3	CH_3	CH_3
256.		CH_3	CH_3	CH_3	CH_3
257.		CH_3	CH_3	CH_3	CH_3
258.		CH_3	CH_3	CH_3	CH_3
259.		CH_3	CH_3	CH_3	CH_3
260.		CH_3	CH_3	CH_3	CH_3
261.		CH_3	CH_3	CH_3	CH_3
262.		CH_3	CH_3	CH_3	CH_3
263.		CH_3	CH_3	CH_3	CH_3

編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
264.		CH_3	CH_3	CH_3	CH_3
265.		CH_3	CH_3	CH_3	C_2H_5
266.		CH_3	CH_3	CH_3	C_2H_5
267.		CH_3	CH_3	CH_3	C_2H_5
268.		CH_3	CH_3	CH_3	C_2H_5
269.		CH_3	CH_3	CH_3	C_2H_5
270.		CH_3	CH_3	CH_3	C_2H_5
271.		CH_3	CH_3	CH_3	C_2H_5
272.		CH_3	CH_3	CH_3	C_2H_5

編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
273.		CH_3	CH_3	CH_3	C_2H_5
274.		CH_3	CH_3	CH_3	C_2H_5
275.		CH_3	CH_3	CH_3	C_2H_5
276.		CH_3	CH_3	C_2H_5	CH_3
277.		CH_3	CH_3	C_2H_5	CH_3
278.		CH_3	CH_3	C_2H_5	CH_3
279.		CH_3	CH_3	C_2H_5	CH_3
280.		CH_3	CH_3	C_2H_5	CH_3
281.		CH_3	CH_3	C_2H_5	CH_3

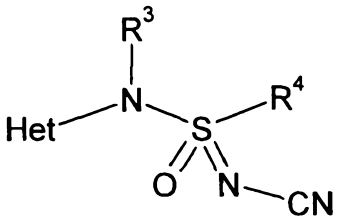
編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
282.		CH_3	CH_3	C_2H_5	CH_3
283.		CH_3	CH_3	C_2H_5	CH_3
284.		CH_3	CH_3	C_2H_5	CH_3
285.		CH_3	CH_3	C_2H_5	CH_3
286.		CH_3	CH_3	C_2H_5	CH_3
287.		CH_3	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
288.		CH_3	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
289.		CH_3	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
290.		CH_3	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
291.		CH_3	CH_3	C_2H_5	C_2H_5

編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
292.		CH_3	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
293.		CH_3	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
294.		CH_3	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
295.		CH_3	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
296.		CH_3	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
297.		CH_3	CH_3	C_2H_5	C_2H_5
298.		CH_3	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	
299.		CH_3	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	
300.		CH_3	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	

編號	Het	R^1	R^2	R^3	R^4
301.		CH_3	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	
302.		CH_3	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	
303.		CH_3	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	
304.		CH_3	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	
305.		CH_3	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	
306.		CH_3	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	
307.		CH_3	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	
308.		CH_3	CH_3	CH_2-CH_2-CH_2	

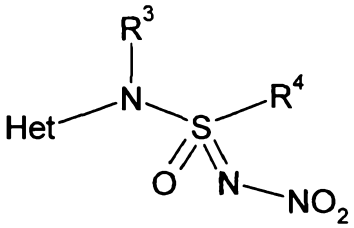
在表C.I中，Het之「#」表示式I中之鍵。

該等尤其較佳化合物之其他實例為式(I-C)化合物，其中R^3、R^4及Het具有表C.II之第C.309列至C.396列中之任一列所給出之含義。



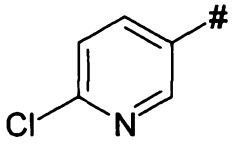
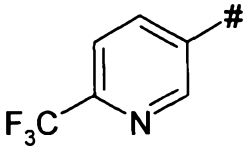
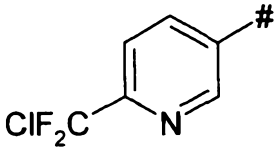
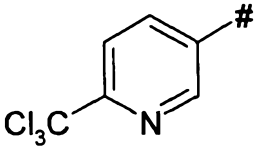
(I-C)

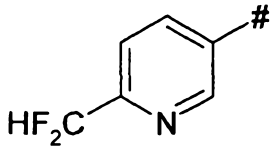
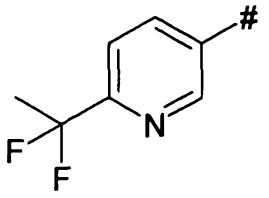
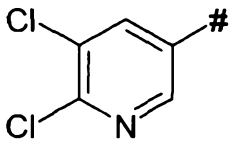
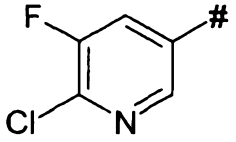
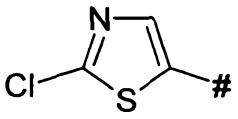
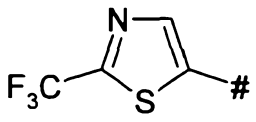
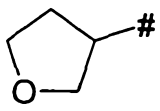
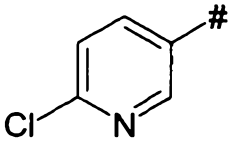
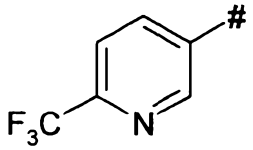
該等尤其較佳化合物之其他實例亦為式(I-D)化合物，其中R^3、R^4及Het具有表C.II之第C.309列至C.396列中之任一列所給出之含義。

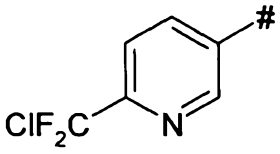
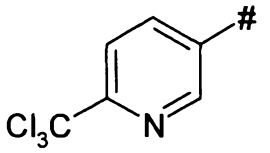
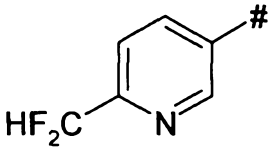
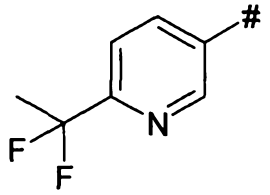
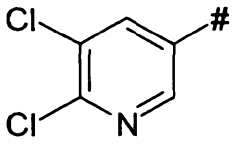
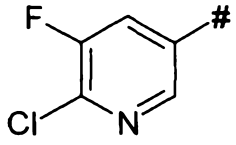
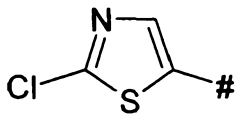
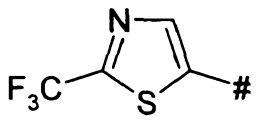
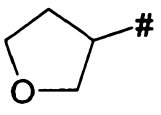


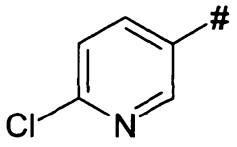
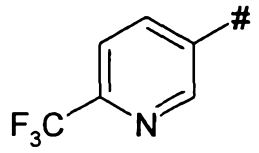
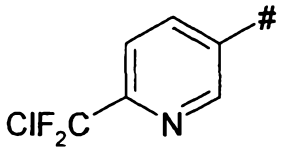
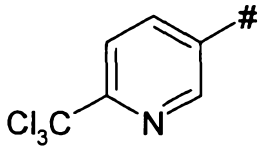
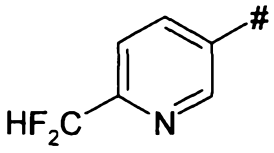
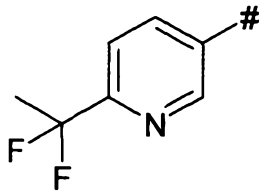
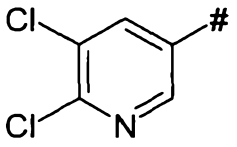
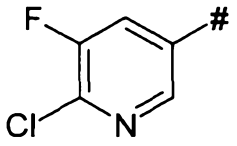
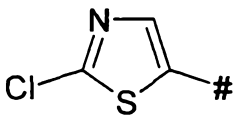
(I-D)

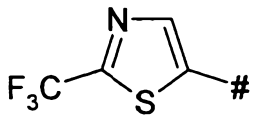
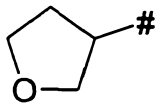
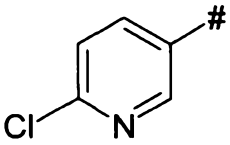
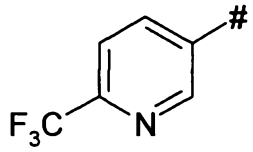
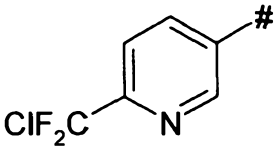
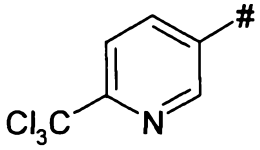
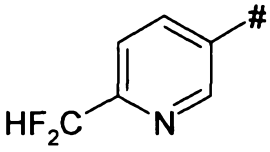
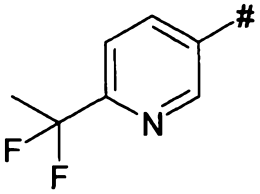
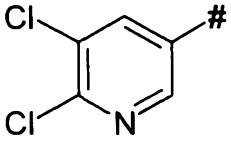
表C.II：

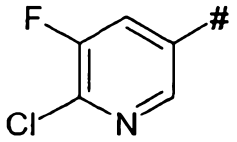
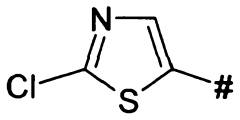
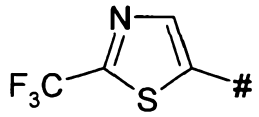
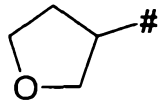
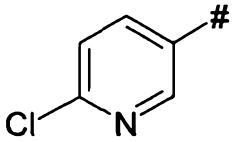
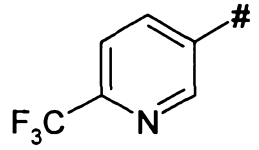
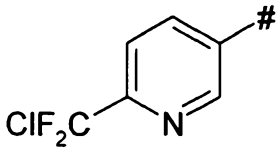
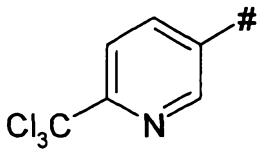
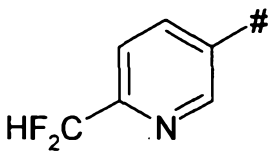
編號	Het	R^3	R^4
309.		H	CH_3
310.		H	CH_3
311.		H	CH_3
312.		H	CH_3

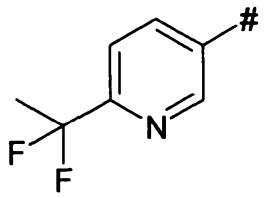
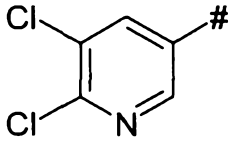
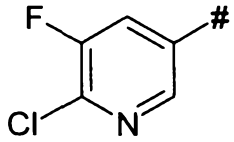
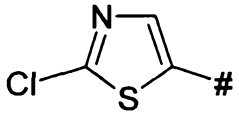
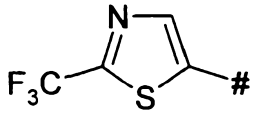
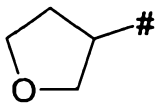
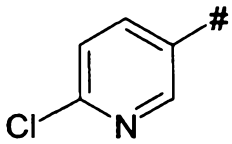
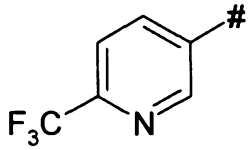
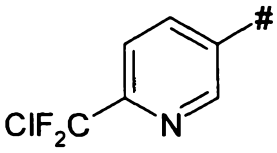
編號	Het	R^3	R^4
313.		H	CH_3
314.		H	CH_3
315.		H	CH_3
316.		H	CH_3
317.		H	CH_3
318.		H	CH_3
319.		H	CH_3
320.		H	C_2H_5
321.		H	C_2H_5

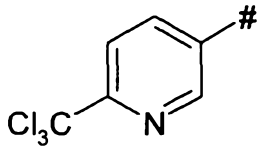
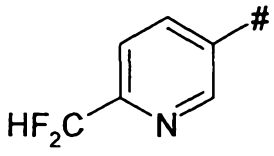
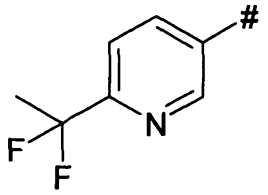
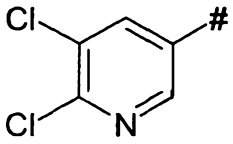
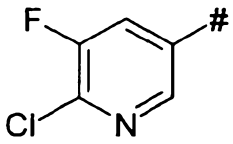
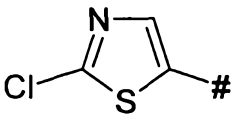
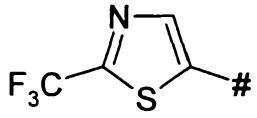
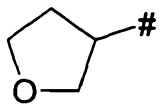
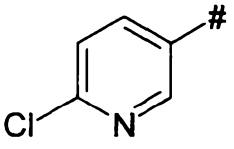
編號	Het	R^3	R^4
322.		H	C_2H_5
323.		H	C_2H_5
324.		H	C_2H_5
325.		H	C_2H_5
326.		H	C_2H_5
327.		H	C_2H_5
328.		H	C_2H_5
329.		H	C_2H_5
330.		H	C_2H_5

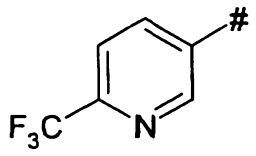
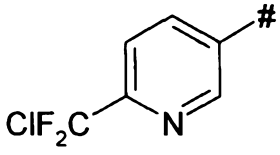
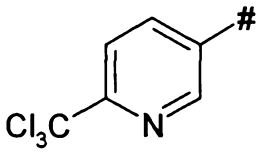
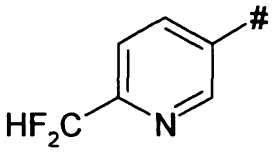
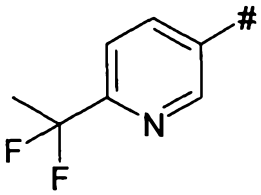
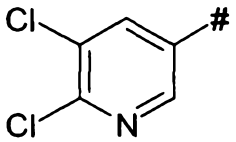
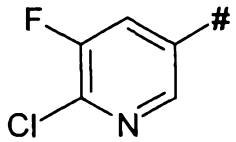
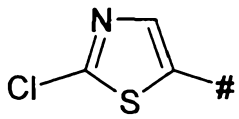
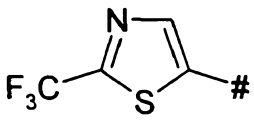
編號	Het	R^3	R^4
331.		CH_3	CH_3
332.		CH_3	CH_3
333.		CH_3	CH_3
334.		CH_3	CH_3
335.		CH_3	CH_3
336.		CH_3	CH_3
337.		CH_3	CH_3
338.		CH_3	CH_3
339.		CH_3	CH_3

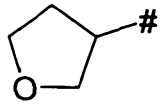
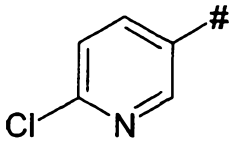
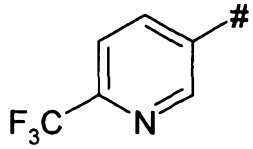
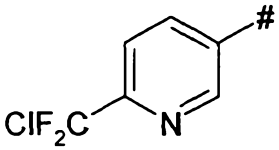
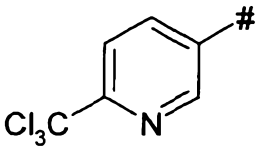
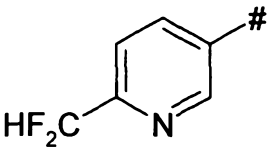
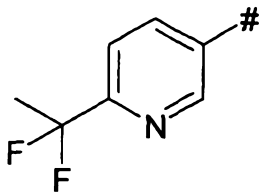
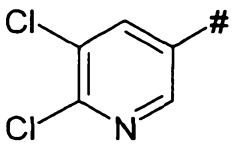
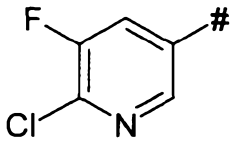
編號	Het	R^3	R^4
340.		CH_3	CH_3
341.		CH_3	CH_3
342.		CH_3	C_2H_5
343.		CH_3	C_2H_5
344.		CH_3	C_2H_5
345.		CH_3	C_2H_5
346.		CH_3	C_2H_5
347.		CH_3	C_2H_5
348.		CH_3	C_2H_5

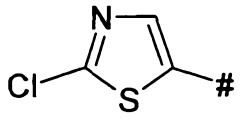
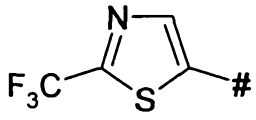
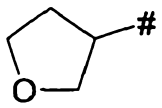
編號	Het	R^3	R^4
349.		CH_3	C_2H_5
350.		CH_3	C_2H_5
351.		CH_3	C_2H_5
352.		CH_3	C_2H_5
353.		C_2H_5	CH_3
354.		C_2H_5	CH_3
355.		C_2H_5	CH_3
356.		C_2H_5	CH_3
357.		C_2H_5	CH_3

編號	Het	R^3	R^4
358.		C_2H_5	CH_3
359.		C_2H_5	CH_3
360.		C_2H_5	CH_3
361.		C_2H_5	CH_3
362.		C_2H_5	CH_3
363.		C_2H_5	CH_3
364.		C_2H_5	C_2H_5
365.		C_2H_5	C_2H_5
366.		C_2H_5	C_2H_5

編號	Het	R^3	R^4
367.		C_2H_5	C_2H_5
368.		C_2H_5	C_2H_5
369.		C_2H_5	C_2H_5
370.		C_2H_5	C_2H_5
371.		C_2H_5	C_2H_5
372.		C_2H_5	C_2H_5
373.		C_2H_5	C_2H_5
374.		C_2H_5	C_2H_5
375.		CH_2-CH_2-CH_2	

編號	Het	R^3	R^4
376.		CH_2-CH_2-CH_2	
377.		CH_2-CH_2-CH_2	
378.		CH_2-CH_2-CH_2	
379.		CH_2-CH_2-CH_2	
380.		CH_2-CH_2-CH_2	
381.		CH_2-CH_2-CH_2	
382.		CH_2-CH_2-CH_2	
383.		CH_2-CH_2-CH_2	
384.		CH_2-CH_2-CH_2	

編號	Het	R^3	R^4
385.		CH_2-CH_2-CH_2	
386.		CH_2-CH_2-CH_2-CH_2	
387.		CH_2-CH_2-CH_2-CH_2	
388.		CH_2-CH_2-CH_2-CH_2	
389.		CH_2-CH_2-CH_2-CH_2	
390.		CH_2-CH_2-CH_2-CH_2	
391.		CH_2-CH_2-CH_2-CH_2	
392.		CH_2-CH_2-CH_2-CH_2	
393.		CH_2-CH_2-CH_2-CH_2	

編號	Het	R^3	R^4
394.		CH_2-CH_2-CH_2-CH_2	
395.		CH_2-CH_2-CH_2-CH_2	
396.		CH_2-CH_2-CH_2-CH_2	

在表C.II中，Het之「#」表示式I中之鍵。

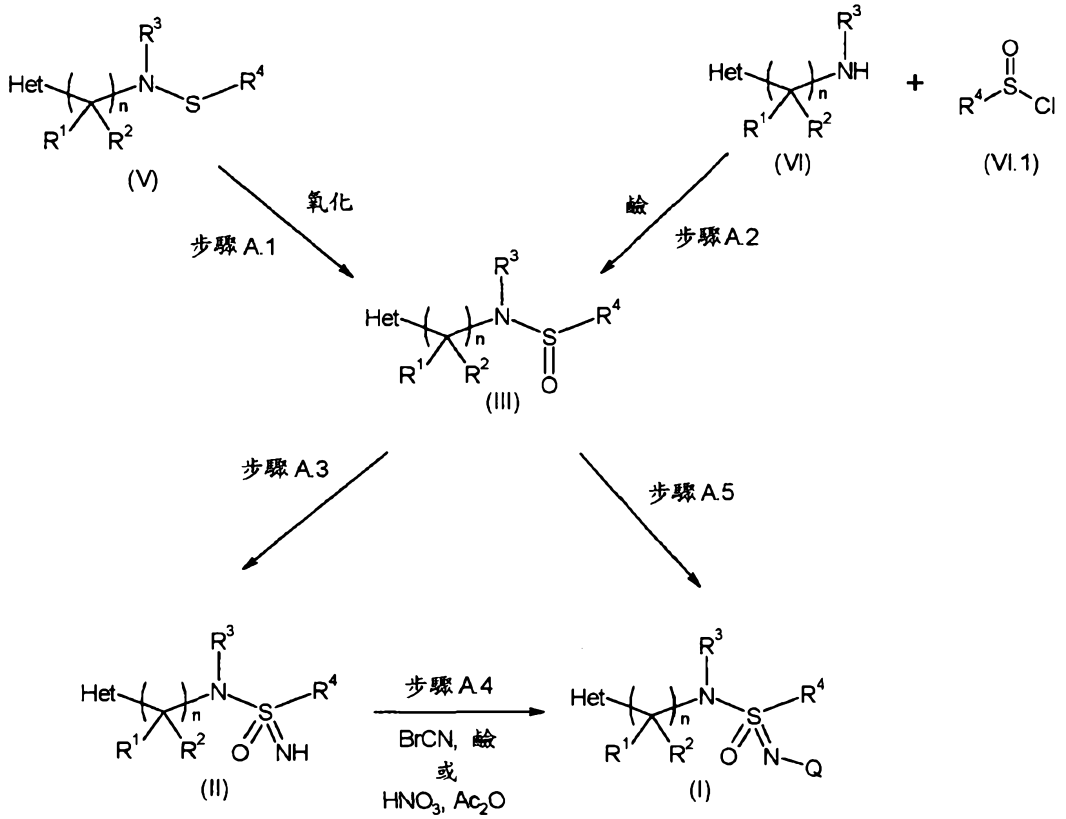
製備方法

本發明之式(I)化合物可(例如)根據如下文所述之製備方法及製備流程來製備。

製備式(I)之磺醯亞胺基胺化合物之方法：

在以下流程及方法中，若未另外說明，則所用式中之取代基、變數及指數之定義對應於上文關於式(I)所給出之定義。

流程A：



步驟A.1： 因此，可藉由在合適溶劑中用適當氧化劑處理使式(V)之次磺醯胺(sulfenamide)氧化成相應亞磺醯胺(sulfinamide)(III)。較佳用過氧化氫進行氧化。可用之溶劑為水；乙腈；羧酸，諸如乙酸、三氟乙酸、丙酸；醇，諸如甲醇、乙醇、異丙醇、第三丁醇、六氟異丙醇；氯化烴，諸如二氯甲烷、1,1,2,2-四氯乙烷；或酮，諸如丙酮或甲基乙基酮。反應可藉由添加諸如三氟乙酸或過氯乙酸之強酸來催化。諸如五氧化二釩、鎢酸鈉之金屬化合物亦為合適之催化劑。其他較佳之氧化劑為過酸，諸如過乙酸、過三氟乙酸或3-氯過氧苯甲酸。

尤其較佳之氧化劑為過氧化氫(在六氟異丙醇存在下)或

3-氯過氧苯甲酸(在低於0℃之溫度下)或過碘酸鈉。

較佳之溶劑為二氯甲烷、氯仿或乙腈且在過碘酸鈉為氧化劑之狀況下包括水及醇(諸如甲醇或乙醇)。

步驟A.2： 合成亞磺醯胺(III)之一不同途徑利用在合適溶劑中於鹼存在下胺(VI)與亞磺醯氯(VI.1)之間的偶合。

合適之鹼一般為無機化合物，諸如鹼金屬及鹼土金屬氧化物，諸如氧化鋰、氧化鈉、氧化鈣及氧化鎂；鹼金屬及鹼土金屬碳酸鹽，諸如碳酸鋰、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸銫及碳酸鈣；以及鹼金屬碳酸氫鹽，諸如碳酸氫鈉；鹼金屬及鹼土金屬醇鹽，諸如甲醇鈉、乙醇鈉、乙醇鉀及第三丁醇鉀；此外有機鹼，例如第三胺(諸如三甲胺、三乙胺、二異丙基乙基胺)及N-甲基哌啶、吡啶、經取代之吡啶(諸如三甲基吡啶、二甲基吡啶及4-二甲基胺基吡啶)以及雙環胺。尤其較佳為諸如碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸銫、三乙胺及碳酸氫鈉之鹼。

較佳使用諸如三乙胺或*N,N*-二異丙基乙基胺之第三胺鹼及諸如二氯甲烷、氯仿或二甲基甲醯胺之溶劑。

步驟A.3： 可如J. Org. Chem. 1989, 54, 986-988中所概述藉由在高溫下於非質子性溶劑中在濃硫酸存在下與疊氮化鈉一起培養使式(III)之亞磺醯胺轉化為相應磺醯亞胺基胺(II)。為避免在高溫下處理有害疊氮酸，此轉化可替代地在較低溫度(例如0℃)下使用發煙硫酸(oleum)作為酸來達成。亦可藉由與*O*-苯基磺醯基胲反應使式(III)之亞磺醯胺亞胺化(參見J. Org. Chem., 39, 16, 1974, 2458-59)。二氯甲

烷或氯仿為此等轉化之較佳溶劑。

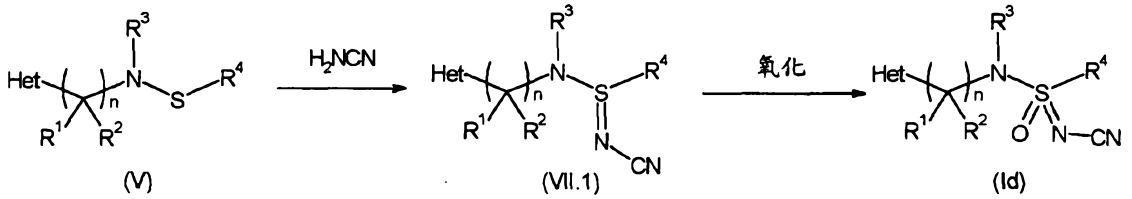
步驟A.4： 可自磺醯亞胺基胺(II)藉由使亞胺之氮原子氧化或硝化來獲得式(I)之*N*-硝基-磺醯亞胺基胺或*N*-氰基-磺醯亞胺基胺。為引入氰基，在諸如*N,N*-二甲基胺基吡啶之鹼存在下將磺醯亞胺基胺與溴化氰一起培養。藉由在適度高溫下於作為催化劑之乙酸酐及硫酸存在下使磺醯亞胺基胺(II)與硝酸反應來達成硝化(參見Synthesis, 1986, 5, 426-7)。

步驟A.5： 亦可如Beilstein J. of Org. Chem. 2007, 3:25, 1中所概述藉由在諸如第三丁醇鉀之鹼及諸如N-氯代丁二醯亞胺之合適氯化劑存在下與氰胺反應使相應亞磺醯胺(III)亞胺化來獲得式(I)之N-氰基-磺醯亞胺基胺。

製備方法中之其他個別途徑概述如下。

其中Q表示CN之式(Id)之*N*-氰基磺醯亞胺基胺可由流程B中所說明之溫和且有效之方法來製備。

流程B：

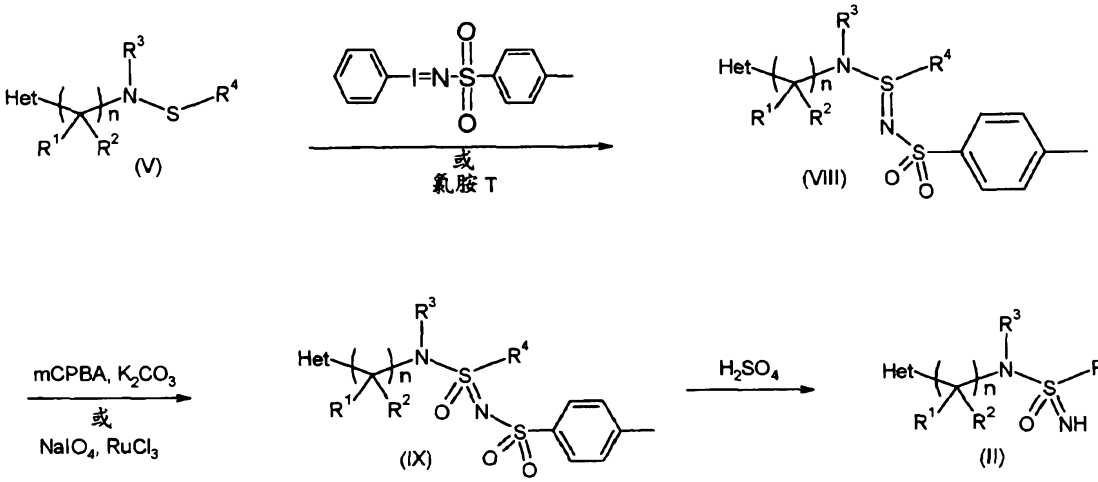


在0℃或周圍溫度下於氰胺存在下用二乙酸氧碘苯(iodosobenzene diacetate)使式(V)之次磺醯胺氧化得到相應亞磺醯亞胺基胺(sulfiliminamide)(VII.1)。此轉化可在諸如二氯甲烷或乙腈之合適溶劑中進行。可藉由在諸如碳酸鉀

或碳酸氫鉀之鹼存在下使用間氯過苯甲酸氧化來達成亞磺醯亞胺基胺(VII.1)至相應磺醯亞胺基胺(Id)之轉化。諸如乙醇與水之混合物的極性質子性溶劑為較佳溶劑；然而，若亞磺醯亞胺基胺起始物質在二氯甲烷中充分可溶，則可使用此溶劑。

式(II)之磺醯亞胺基胺亦可使用如流程C及D中所說明之替代途徑自次磺醯胺(V)起始來製備。

流程C：

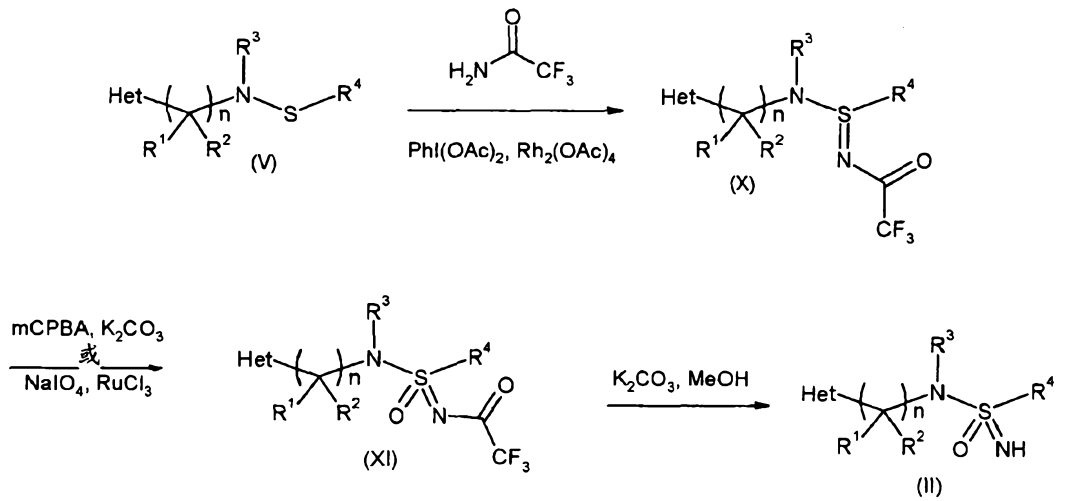


因此，在催化性乙酸銠(II)存在下使次磺醯胺(V)與*N*-氯-對甲苯磺醯胺(氯胺T)及鹼反應或與4-甲基-*N*-(苯基伸碘基)-苯磺醯胺反應得到*N*-甲苯磺醯基-亞磺醯亞胺基胺(VIII)。諸如二氯甲烷或乙腈之極性非質子性溶劑為此轉化之較佳溶劑。可藉由在諸如碳酸鉀之鹼存在下用間氯過苯甲酸(mCPBA)氧化使*N*-甲苯磺醯基-亞磺醯亞胺基胺(VIII)轉化為相應*N*-甲苯磺醯基-磺醯亞胺基胺(IX)。或者，亦可在諸如二氯甲烷、氯仿或乙腈之合適溶劑中於催化性三氯化釕或類似催化劑存在下使用過碘酸鈉水溶液來

製備磺醯亞胺基胺(IX)。可藉由在周圍溫度下用濃硫酸處理*N*-甲苯磺醯基-磺醯亞胺基胺(IX)來達成甲苯磺醯基的移除以得到磺醯亞胺基胺(II)。

自次磺醯胺(V)製備磺醯亞胺基胺(II)之另一途徑概述於流程D中。

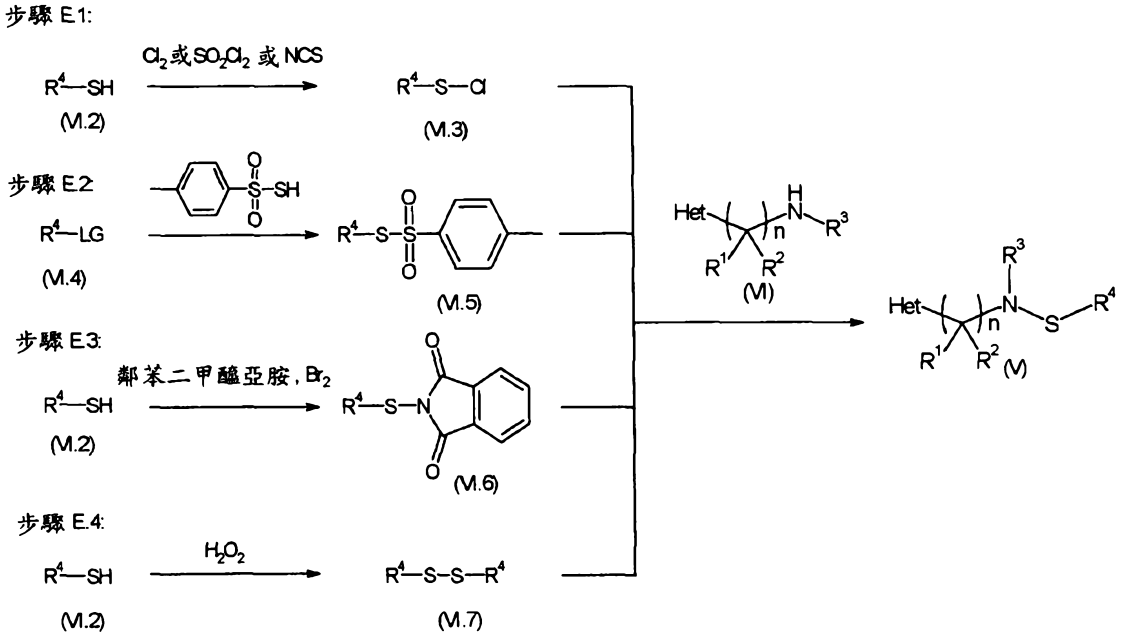
流程D：



在諸如二乙酸銠之催化劑及諸如氧化鎂之鹼存在下使次磺醯胺(V)與二乙酸氧碘苯及三氟乙醯胺反應得到經*N*-三氟乙醯基保護之亞磺醯亞胺基胺(X)。反應較佳在諸如二氯甲烷之極性非質子性溶劑中進行。在鹼存在下用間氯過苯甲酸或在諸如三氯化釕之催化劑存在下用過碘酸鈉水溶液使式(X)之亞磺醯亞胺基胺氧化得到經*N*-三氟乙醯基保護之磺醯亞胺基胺(XI)。在質子性溶劑中將此等中間物與鹼一起培養使得三氟乙醯基去保護以得到磺醯亞胺基胺(II)。較佳使用於諸如甲醇或乙醇之溶劑中之碳酸鉀作為鹼。

流程A至D中之式(V)之次磺醯胺起始物質可使用如流程E中所說明之若干不同途徑來製備。

流程E：



步驟E.1： 硫醇(VI.2)氯化所獲得之式(VI.3)之次磺醯鹵表示最早已知之次磺醯基轉移試劑(參見，例如Chem. Rev. 1989, 89 (4), 689-712)。硫醇氯化之較佳條件包括在諸如二氯甲烷或甲苯之非質子性溶劑中且在諸如三乙胺或吡啶之氮鹼存在下使用氯氣、硫醯氯或*N*-氯代丁二醯亞胺作為氯化試劑。在胺鹼存在下使所得次磺醯鹵與胺(VI)反應以清除在極性非質子性溶劑中所釋放之鹽酸，得到所要次磺醯胺(V)。

步驟E.2： 亦可如J. Org. Chem. 1977, 31, 2842-2846中所述自硫醇磺酸酯(VI.5)起始藉由與胺(VI)反應來得到次磺醯胺(V)。硫醇磺酸酯中間物可易於藉由在鹼存在下使用其中LG表示離去基(諸如鹵基、三氟甲磺酸酯基等)之適

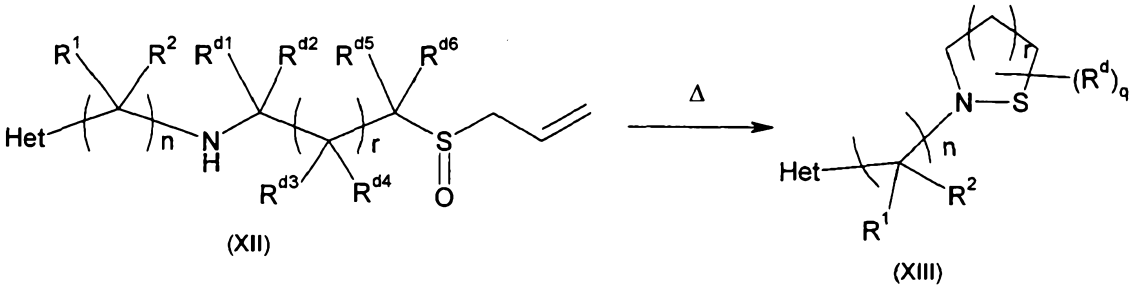
當烷基化劑R^4-LG(VI.4)使硫代磺酸(或其鹽)S-烷基化而得到。

步驟E.3： 因此，亦可如Tetrahedron Lett. 1971, 52, 4953-4956中所述在周圍溫度或高溫下使根據Tetrahedron 1997, 53 (42), 14411-14416中所概述之條件自硫醇(VI.2)及鄰苯二甲醯亞胺製備之次磺醯亞胺(sulfenimide)(VI.6)與胺(VI)反應以得到次磺醯胺(V)。諸如二氯甲烷或甲苯之非質子性溶劑對此轉化而言為較佳的。

步驟E.4： 二硫醚(VI.7)之金屬離子輔助型斷裂及隨後與胺(VI)反應表示自硫醇(VI.2)起始得到次磺醯胺(V)之另一途徑(參見，例如J. Org. Chem. 1977, 42, 967-972)。較佳使用單價銀-I及二價汞-II鹽，諸如硝酸銀、乙酸銀或氯化汞。

其中R^3及R^4形成飽和5員或6員環(意謂r等於1或2)之式(XIII)之環狀次磺醯胺亦可如流程F中所概述來製備。

流程F：



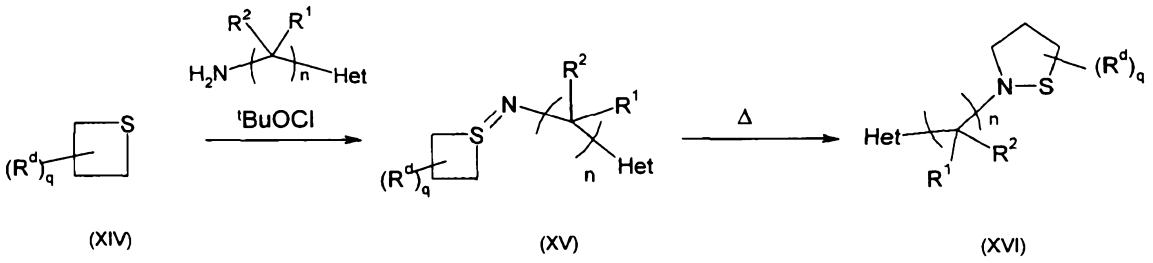
(XII) (XIII)

因此，如Heterocycles 1985, 23 (8), 1897-1900中所述，高溫能夠使烯丙基亞碸(XII)進行米斯羅-埃文斯重排(Mislow-Evans rearrangement)，接著胺氮原子攻擊瞬間產

生之次磺酸烯丙酯，使得分子內環閉合成相應環狀次磺醯胺(XIII)。此轉化較佳在諸如環己烷或乙酸乙酯之非質子性溶劑中進行。烯丙基亞碸中間物(XII)可如上文所引用之參考文獻中所概述衍生自丙烯醛或由熟習此項技術者所知之標準合成方法自不同起始物質獲得。在流程F中，R^{d1}-R^{d6}係彼此獨立地且與r無關地選擇且對應於如先前所定義之R^d，且q可表示選自0、1或2之整數。

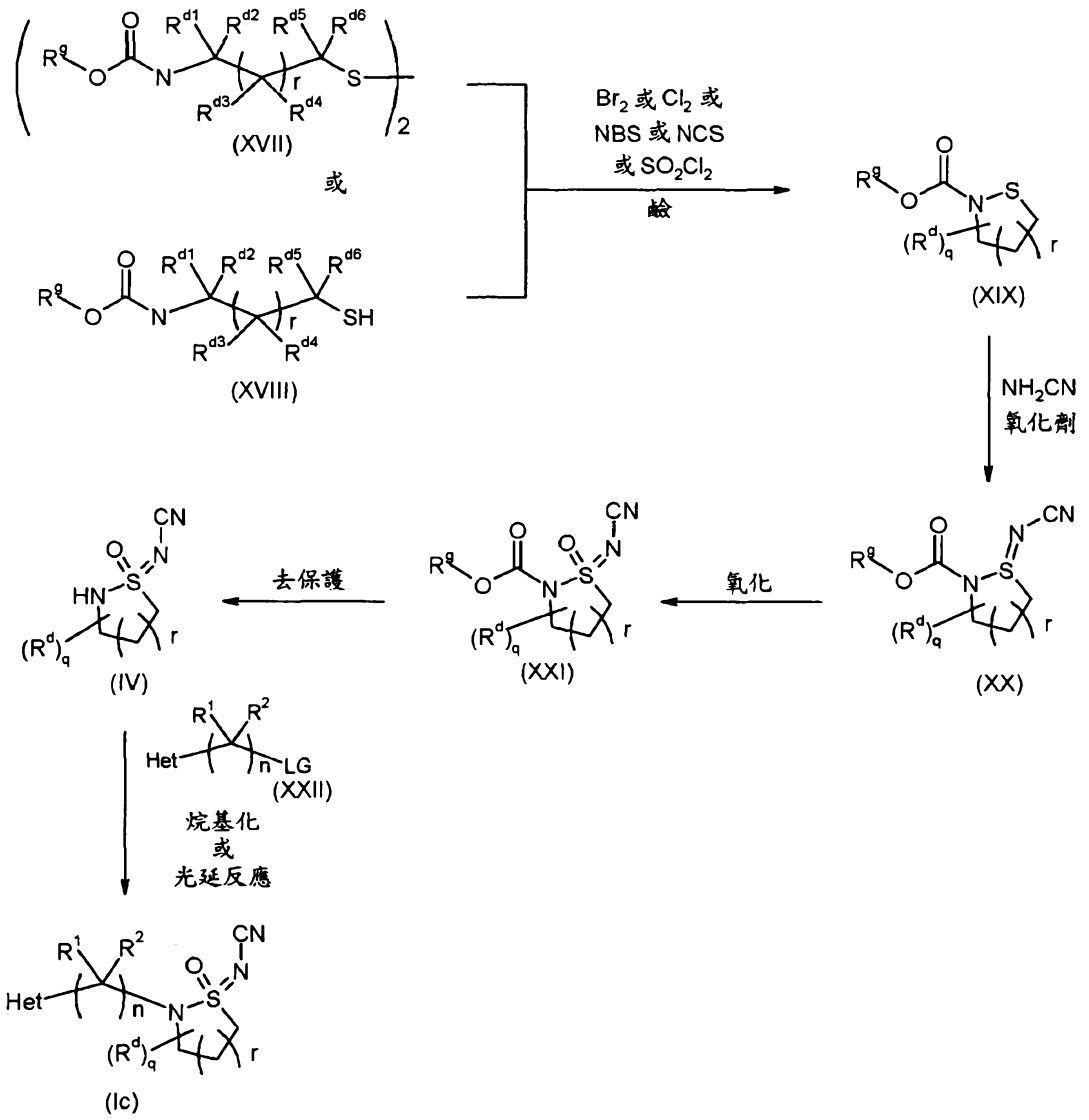
其中R^3及R^4形成飽和5員環之式(XVI)之環狀次磺醯胺亦可如流程G中所述自硫雜環丁烷衍生物(XIV)起始來獲得。

流程G：



因此，如Monatshefte für Chemie 1985, 116 (10), 1153-1164中所述在第一胺存在下使式(XIV)之硫雜環丁烷與第三丁基次氯化物反應得到式(XV)之亞磺醯亞胺(sulfilimine)。在周圍溫度或高溫下此等亞磺醯亞胺(XV)重排以得到相應噻唑啶(XVI)。此轉化之較佳溶劑為氯仿。

流程H：



其中R^3及R^4形成飽和5員或6員環(亦即，r等於1或2)，q表示選自0、1或2之整數且R^d如先前所定義之式(Ic)之環狀磺醯亞胺基胺亦可如流程H中所概述來製備，其中R^{d1}-R^{d6}係彼此獨立地且與r無關地選擇且對應於如先前所定義之R^d且R^g為C_1-C_4烷基，其中碳原子可帶有1或2個選自苯基、C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基或C_2-C_6烯基之基團的任何組合。

因此，可藉由在諸如吡啶之鹼存在下與諸如Br_2、Cl_2、

NBS、NCS或SO_2Cl_2之試劑一起培養使經胺甲醯基保護之胺基二硫醚(XVII)或胺基硫醇(XVIII)轉化為環狀次磺醯胺(XIX)。此轉化較佳在諸如二氯甲烷或甲苯之非質子性溶劑中進行。

可自次磺醯胺(XIX)藉由在諸如二乙酸氧碘苯或第三丁基次氯化物之氧化劑存在下與氰胺或氰胺鈉反應來獲得亞磺醯亞胺基胺(XX)。此轉化係在諸如二氯甲烷或乙腈之合適溶劑中進行。

可藉由使用(例如)NaOCl水溶液或第三丁基次氯化物作為氧化劑氧化來達成亞磺醯亞胺基胺(XX)至相應經胺甲醯基保護之磺醯亞胺基胺(XXI)的轉化。此轉化較佳在H_2O與諸如二氯甲烷之氯化溶劑的兩相混合物中且在諸如溴化四丁基銨之相轉移催化劑存在下進行。

如(例如)T. M. Greene, P. G. M. Wuts, Protecting Groups in Organic Chemistry，第3版，John Wiley & Sons, New York 1999中所詳述，視殘基R^a之性質而定，可由適合於相應保護基之方法來達成胺基甲酸酯基去保護以得到環狀磺醯亞胺基胺(IV)。

式(Ic)之磺醯亞胺基胺可自未經保護之磺醯亞胺基胺(IV)藉由在極性非質子性溶劑中於鹼存在下用合適之類似物(XXII)(其中LG表示適當離去基(例如鹵基))烷基化而得到。如O. Mitsunobu, Y. Yamada, Bull. Chem. Soc. Japan 1967, 40, 2380-2382中所詳述，此轉化較佳在光延條件(Mitsunobu-condition)下在(XXII)為醇衍生物(LG = OH)之

情況下進行。

若個別化合物不可經由上文所述之途徑製備，則其可藉由自其他化合物I衍生或藉由對所述合成途徑進行習慣性修改來製備。

反應混合物係以習用方式處理，例如藉由與水混合，使各相分離，且適當時藉由(例如)在氧化鋁或矽膠上進行層析來純化粗產物。一些中間物及最終產物可以無色或淡棕色黏性油狀物之形式獲得，其在減壓下且在適度高溫下自揮發性組分分離或純化。若獲得呈固體狀之中間物及最終產物，則其可藉由再結晶或蒸煮而純化。

害蟲

式I化合物及其鹽尤其適合於有效控制諸如蜘蛛類動物、多足類動物及昆蟲之節肢動物類害蟲以及線蟲。

式I化合物尤其適合於有效對抗以下害蟲：

鱗翅目(*Lepidoptera*)昆蟲，例如小地老虎(*Agrotis ypsilon*)、黃地老虎(*Agrotis segetum*)、棉葉波紋葉蛾(*Alabama argillacea*)、黎豆夜蛾(*Anticarsia gemmatalis*)、蘋實巢蛾(*Argyresthia conjugella*)、丫紋夜蛾(*Autographa gamma*)、松樹尺蠖(*Bupalus piniarius*)、後黃小捲蛾(*Cacoecia murinana*)、棉褐帶捲蛾(*Capua reticulana*)、小冬蛾(*Cheimatobia brumata*)、雲杉捲葉蛾(*Choristoneura fumiferana*)、西方雲杉蚜蟲(*Choristoneura occidentalis*)、美洲黏蟲(*Cirphis unipuncta*)、蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella*)、歐洲松毛蟲(*Dendrolimus pini*)、瓜野螟

(*Diaphania nitidalis*)、巨座玉米螟(*Diatraea grandiosella*)、埃及金剛鑽(*Earias insulana*)、小玉米螟(*Elasmopalpus lignosellus*)、葡萄螟蛾(*Eupoecilia ambiguella*)、歐洲松枝蛾(*Evetria bouliana*)、粒膚地老虎(*Feltia subterranea*)、大蠟螟(*Galleria mellonella*)、李小食心蟲(*Grapholitha funebrana*)、梨小食心蟲(*Grapholitha molesta*)、棉鈴蟲(*Heliothis armigera*)、美洲菸葉蛾(*Heliothis virescens*)、美洲棉鈴蟲(*Heliothis zea*)、菜螟(*Hellula undalis*)、灰裙尺蠖蛾(*Hibernia defoliaria*)、美國白蛾(*Hyphantria cunea*)、蘋果巢蛾(*Hyponomeuta malinellus*)、番茄蠹蛾(*Keiferia lycopersicella*)、鐵杉尺蠖(*Lambdina fiscellaria*)、甜菜夜蛾(*Laphygma exigua*)、咖啡潛葉蛾(*Leucoptera coffeella*)、旋紋潛葉蛾(*Leucoptera scitella*)、斑點潛葉蛾(*Lithocolletis blancardella*)、葡萄漿果小捲蛾(*Lobesia botrana*)、黃綠條螟(*Loxostege sticticalis*)、舞毒蛾(*Lymantria dispar*)、僧尼毒蛾(*Lymantria monacha*)、窄翅潛葉蛾(*Lyonetia clerkella*)、天幕毛蟲(*Malacosoma neustria*)、甘藍夜蛾(*Mamestra brassicae*)、花旗松毒蛾(*Orgyia pseudotsugata*)、歐洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis*)、冬夜蛾(*Panolis flammea*)、紅鈴蟲(*Pectinophora gossypiella*)、雜色地老虎(*Peridroma saucia*)、圓掌舟蛾(*Phalera bucephala*)、馬鈴薯塊莖蛾(*Phthorimaea operculella*)、橘細潛蛾(*Phyllocnistis citrella*)、大菜粉蝶(*Pieris brassicae*)、苜蓿綠夜蛾(*Plathypena scabra*)、小菜蛾(*Plutella xylostella*)、

大豆夜蛾(*Pseudoplusia includens*)、松梢捲葉蛾(*Rhyacionia frustrana*)、番茄潛葉蛾(*Scrobipalpula absoluta*)、麥蛾(*Sitotroga cerealella*)、葡萄長鬚捲葉蛾(*Sparganothis pilleriana*)、草地黏蟲(*Spodoptera frugiperda*)、灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis*)、斜紋夜蛾(*Spodoptera litura*)、松異帶蛾(*Thaumatopoea pityocampa*)、櫟綠捲葉蛾(*Tortrix viridana*)、粉紋夜蛾(*Trichoplusia ni*)及雲杉小捲葉蛾(*Zeiraphera canadensis*)；

甲蟲(鞘翅目(*Coleoptera*))，例如梨長吉丁(*Agrilus sinuatus*)、具條叩甲(*Agriotes lineatus*)、黯金針蟲(*Agriotes obscurus*)、馬鈴薯鰓金龜(*Amphimallus solstitialis*)、鳳尾蟲(*Anisandrus dispar*)、棉鈴象甲(*Anthonomus grandis*)、蘋果花象甲(*Anthonomus pomorum*)、尤氣雷德跳甲(*Aphthona euphoridae*)、普通扣甲(*Athous haemorrhoidalis*)、甜菜隱食甲(*Atomaria linearis*)、大松小蠹(*Blastophagus piniperda*)、天幕枯葉蛾(*Blitophaga undata*)、蠶豆象(*Bruchus rufimanus*)、豌豆象(*Bruchus pisorum*)、扁豆象(*Bruchus lentis*)、蘋果捲葉象甲(*Byctiscus betulae*)、甜菜大龜甲(*Cassida nebulosa*)、豆葉甲(*Cerotoma trifurcata*)、金花金龜(*Cetonia aurata*)、甘藍莢象甲(*Ceuthorrhynchus assimilis*)、油菜象鼻蟲(*Ceuthorrhynchus napi*)、甜菜脛跳甲(*Chaetocnema tibialis*)、菸草金針蟲(*Conoderus vespertinus*)、天冬負泥甲(*Crioceris asparagi*)、藍翼扣甲亞種(*Ctenicera ssp.*)、長角葉甲(*Diabrotica longicornis*)、

半點狀玉米根蟲(*Diabrotica semipunctata*)、十二星瓜葉甲(*Diabrotica 12-punctata*)、南美葉甲(*Diabrotica speciosa*)、玉米根葉甲(*Diabrotica virgifera*)、墨西哥豆瓢蟲(*Epilachna varivestis*)、菸草跳甲(*Epitrix hirtipennis*)、橡膠象甲(*Eutinobothrus brasiliensis*)、松樹象甲(*Hylobius abietis*)、埃及苜蓿象甲(*Hypera brunneipennis*)、苜蓿葉象甲(*Hypera postica*)、雲杉八齒小蠹(*Ips typographus*)、具條負泥蟲(*Lema bilineata*)、黑角負泥蟲(*Lema melanopus*)、馬鈴薯甲蟲(*Leptinotarsa decemlineata*)、甜菜金針蟲(*Limonius californicus*)、稻象甲(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、玉米線蟲(*Melanotus communis*)、油菜露尾甲(*Meligethes aeneus*)、忽布鰓角金龜(*Melolontha hippocastani*)、西方五月鰓金龜(*Melolontha melolontha*)、稻負泥蟲(*Oulema oryzae*)、葡萄根象甲(*Otiorrhynchus sulcatus*)、草莓根象甲(*Otiorrhynchus ovatus*)、辣根猿葉甲(*Phaedon cochleariae*)、樹葉象甲(*Phyllobius pyri*)、油菜藍金龜(*Phyllotreta chrysocephala*)、金龜種(*Phyllophaga sp.*)、庭園麗金龜(*Phyllopertha horticola*)、蕪菁淡足跳甲(*Phyllotreta nemorum*)、黃曲條跳甲(*Phyllotreta striolata*)、日本麗金龜(*Popillia japonica*)、豌豆葉象甲(*Sitona lineatus*)及穀象(*Sitophilus granaria*)；

蠅、蚊(雙翅目(*Diptera*))，例如埃及伊蚊(*Aedes aegypti*)、白紋伊蚊(*Aedes albopictus*)、刺擾伊蚊(*Aedes vexans*)、墨西哥橘實蠅(*Anastrepha ludens*)、五斑按蚊

(*Anopheles maculipennis*)、災難按蚊(*Anopheles crucians*)、白足按蚊(*Anopheles albimanus*)、瘧蚊(*Anopheles gambiae*)、弗氏按蚊(*Anopheles freeborni*)、白踝按蚊(*Anopheles leucosphyrus*)、微小按蚊(*Anopheles minimus*)、四斑按蚊(*Anopheles quadrimaculatus*)、紅頭麗蠅(*Calliphora vicina*)、地中海實蠅(*Ceratitis capitata*)、蛆症金蠅(*Chrysomya bezziana*)、美洲金蠅(*Chrysomya hominivorax*)、美洲稻水蠅(*Chrysomya macellaria*)、鹿蠅(*Chrysops discalis*)、靜斑虻(*Chrysops silacea*)、大西洋黃虻(*Chrysops atlanticus*)、螺旋蠅(*Cochliomyia hominivorax*)、高粱癭蚊(*Contarinia sorghicola*)、盾波蠅(*Cordylobia anthropophaga*)、狂怒庫蠓(*Culicoides furens*)、五帶淡色庫蚊(*Culex pipiens*)、環紋庫蚊(*Culex nigripalpus*)、熱帶家蚊(*Culex quinquefasciatus*)、媒斑蚊(*Culex tarsalis*)、冬蚊(*Culiseta inornata*)、黑尾睫毛蚊(*Culiseta melanura*)、瓜實蠅(*Dacus cucurbitae*)、油橄欖實蠅(*Dacus oleae*)、芸苔莢癭蚊(*Dasineura brassicae*)、蔥蠅(*Delia antique*)、麥種蠅(*Delia coarctata*)、種蠅(*Delia platura*)、甘藍地種蠅(*Delia radicum*)、人膚蠅(*Dermatobia hominis*)、黃腹廄蠅(*Fannia canicularis*)、馬鈴薯禾蠅(*Geomyza Tripunctata*)、大馬胃蠅(*Gasterophilus intestinalis*)、刺舌蠅(*Glossina morsitans*)、鬚舌蠅(*Glossina palpalis*)、引舌蠅(*Glossina fuscipes*)、膠舌蠅(*Glossina tachinoides*)、騷擾角蠅(*Haematobia irritans*)、蝴蝶蘭潛蠅(*Haplodiplosis equestris*)、潛蠅屬(*Hippelates spp.*)、

種蠅(*Hylemyia platura*)、紋皮蠅(*Hypoderma lineata*)、急流細蠓(*Leptoconops torrens*)、美洲斑潛蠅(*Liriomyza sativae*)、三葉斑潛蠅(*Liriomyza trifolii*)、山羊綠蠅(*Lucilia caprina*)、銅綠蠅(*Lucilia cuprina*)、絲光綠蠅(*Lucilia sericata*)、白楊花蠅(*Lycoria pectoralis*)、替特納孟松蚊(*Mansonia titillanus*)、黑森麥桿蠅(*Mayetiola destructor*)、秋家蠅(*Musca autumnalis*)、家蠅(*Musca domestica*)、廄腐蠅(*Muscina stabulans*)、羊鼻蠅(*Oestrus ovis*)、黃禾蠅(*Opomyza florum*)、瑞典麥稈蠅(*Oscinella frit*)、甜菜潛葉蠅(*Pegomya hysocyami*)、洋蔥蠅(*Phorbia antiqua*)、甘藍蠅(*Phorbia brassicae*)、麥種蠅(*Phorbia coarctata*)、安氏白蛉(*Phlebotomus argentipes*)、哥倫比亞壞血蚊(*Psorophora columbiae*)、胡蘿蔔蠅(*Psila rosae*)、變色鱗蚊(*Psorophora discolor*)、混合原蚋(*Prosimulium mixtum*)、櫻桃實蠅(*Rhagoletis cerasi*)、蘋果實蠅(*Rhagoletis pomonella*)、紅尾肉蠅(*Sarcophaga haemorrhoidalis*)、麻蠅屬(*Sarcophaga spp.*)、帶蚋(*Simulium vittatum*)、廄螯蠅(*Stomoxys calcitrans*)、牛虻(*Tabanus bovinus*)、北美黑虻(*Tabanus atratus*)、條紋虻(*Tabanus lineola*)及擬馬虻(*Tabanus similis*)、甘藍大蚊(*Tipula oleracea*)及歐洲大蚊(*Tipula paludosa*)；

薊馬(纓翅目(*Thysanoptera*))，例如蘭花薊馬(*Dichromothrips corbetti*)、蘭花薊馬亞種(*Dichromothrips ssp.*)、菸草褐薊馬(*Frankliniella fusca*)、苜蓿薊馬(*Frankliniella occidentalis*)、

花薊馬(*Frankliniella tritici*)、橘實薊馬(*Scirtothrips citri*)、稻薊馬(*Thrips oryzae*)、南黃薊馬(*Thrips palmi*)及菸薊馬(*Thrips tabaci*)；

白蟻(等翅目(*Isoptera*))，例如黃頸木白蟻(*Calotermes flavicollis*)、黃肢白蟻(*Leucotermes flavipes*)、金色異白蟻(*Heterotermes aureus*)、黃肢散白蟻(*Reticulitermes flavipes*)、南方散白蟻(*Reticulitermes virginicus*)、歐洲散白蟻(*Reticulitermes lucifugus*)、桑特散白蟻(*Reticulitermes santonensis*)、格瑞斯散白蟻(*Reticulitermes grassei*)、納塔爾白蟻(*Termes natalensis*)及臺灣乳白蟻(*Coptotermes formosanus*)；

蟑螂(蜚蠊目(*Blattaria-Blattodea*))，例如德國小蠊(*Blattella germanica*)、亞洲蟑螂(*Blattella asahinae*)、美洲大蠊(*Periplaneta americana*)、日本大蠊(*Periplaneta japonica*)、棕色大蠊(*Periplaneta brunnea*)、黑胸大蠊(*Peroplaneta fuligginosa*)、澳洲大蠊(*Periplaneta australasiae*)及東方蜚蠊(*Blatta orientalis*)；

臭蟲、蚜蟲、葉蟬、粉虱、介殼蟲、蟬(半翅目(*Hemiptera*))，例如喜綠蝽(*Acrosternum hilare*)、多毛長蝽(*Blissus leucopterus*)、菸草黑斑盲蝽(*Cyrtopeltis notatus*)、棉紅蝽(*Dysdercus cingulatus*)、汙棉蟲(*Dysdercus intermedius*)、麥扁盾蝽(*Eurygaster integriceps*)、棉褐蝽(*Euschistus impictiventris*)、葉足緣蝽(*Leptoglossus phyllopus*)、牧草盲蝽(*Lygus lineolaris*)、牧草盲蝽(*Lygus pratensis*)、稻綠

蝽(*Nezara viridula*)、甜菜撿網蝽(*Piesma quadrata*)、英島麥蝽(*Solubea insularis*)、培地稻綠蝽(*Thyanta perditor*)、紅豆草無網長管蚜(*Acyrthosiphon onobrychis*)、落葉松球蚜(*Adelges laricis*)、鼠李馬鈴薯蚜(*Aphidula nasturtii*)、豔豆蚜(*Aphis fabae*)、草莓根蚜(*Aphis forbesi*)、蘋果蚜(*Aphis pomi*)、棉蚜(*Aphis gossypii*)、醋栗蚜(*Aphis grossulariae*)、鼠李蚜(*Aphis schneideri*)、繡線菊蚜(*Aphis spiraecola*)、接骨木蚜(*Aphis sambuci*)、豌豆蚜(*Acyrthosiphon pisum*)、馬鈴薯長鬚蚜(*Aulacorthum solani*)、銀葉粉虱(*Bemisia argentifolii*)、薊短尾蚜(*Brachycaudus cardui*)、光管舌尾蚜(*Brachycaudus helichrysi*)、桃黑短尾蚜(*Brachycaudus persicae*)、梅蚜(*Brachycaudus prunicola*)、甘藍蚜(*Brevicoryne brassicae*)、角釘毛蚜(*Capitophorus horni*)、方翅網蝽(*Cerosipha gossypii*)、草莓釘蚜(*Chaetosiphon fragaefolii*)、茶蔗隱瘤額蚜(*Cryptomyzus ribis*)、諾曼尼椎球蚜(*Dreyfusia nordmannianae*)、冷杉椎球蚜(*Dreyfusia piceae*)、根瘤蚜(*Dysaphis radicola*)、蘋果溝無網蚜(*Dysaulacorthum pseudosolani*)、蘋粉紅劣蚜(*Dysaphis plantaginea*)、梨樹篷子蚜(*Dysaphis pyri*)、豔豆微葉蟬(*Empoasca fabae*)、梅大尾蚜(*Hyalopterus pruni*)、茶蔗苦菜蚜(*Hyperomyzus lactucae*)、麥長管蚜(*Macrosiphum avenae*)、大戟長管蚜(*Macrosiphum euphorbiae*)、薔薇長管蚜(*Macrosiphon rosae*)、豔豆修尾蚜(*Megoura viciae*)、梨草蚜(*Melanaphis pyrarius*)、薔薇麥蚜(*Metopolophium*

dirhodum)、桃蚜(*Myzus persicae*)、冬蔥蚜(*Myzus ascalonicus*)、櫻桃黑瘤額蚜(*Myzus cerasi*)、桃捲葉蚜(*Myzus varians*)、萬苣蚜(*Nasonovia ribis-nigri*)、褐稻虱(*Nilaparvata lugens*)、囊柄癭綿蚜(*Pemphigus bursarius*)、蔗飛虱(*Perkinsiella saccharicida*)、蛇麻疣額蚜(*Phorodon humuli*)、蘋木虱(*Psylla mali*)、梨木虱(*Psylla piri*)、冬蔥縊瘤蚜(*Rhopalomyzus ascalonicus*)、玉米縊管蚜(*Rhopalosiphum maidis*)、禾穀縊管蚜(*Rhopalosiphum padi*)、蘋草縊管蚜(*Rhopalosiphum insertum*)、馬萊圓尾蚜(*Sappaphis mala*)、馬里圓尾蚜(*Sappaphis mali*)、麥二叉蚜(*Schizaphis graminum*)、榆梨綿蚜(*Schizoneura lanuginosa*)、麥長管蚜(*Sitobion avenae*)、溫室白粉虱(*Trialeurodes vaporariorum*)、大桔蚜(*Toxoptera aurantiiand*)、葡萄根瘤蚜(*Viteus vitifolii*)、溫帶臭蟲(*Cimex lectularius*)、熱帶臭蟲(*Cimex hemipterus*)、白頭獵蝽(*Reduvius senilis*)、錐鼻蟲屬(*Triatoma spp.*)及輪背獵蝽(*Arilus critatus*)；

螞蟻、蜜蜂、黃蜂、鋸蜂(膜翅目(*Hymenoptera*))，例如新疆菜葉蜂(*Athalia rosae*)、大頭切葉蟻(*Atta cephalotes*)、水狸蟻(*Atta capiguara*)、大頭切葉蟻、光滑切葉蟻(*Atta laevigata*)、羅布斯特切葉蟻(*Atta robusta*)、塞克斯登斯切葉蟻(*Atta sexdens*)、德克薩斯切葉蟻(*Atta texana*)、舉尾蟻屬(*Crematogaster spp.*)、櫻實葉蜂(*Hoplocampa minuta*)、蘋葉蜂(*Hoplocampa testudinea*)、黑毛蟻(*Lasius niger*)、廚蟻(*Monomorium pharaonis*)、熱帶火蟻(*Solenopsis geminata*)、

紅火蟻(*Solenopsis invicta*)、黑火蟻(*Solenopsis richteri*)、南部火蟻(*Solenopsis xyloni*)、紅收穫蟻(*Pogonomyrmex barbatus*)、加利福尼亞收穫蟻(*Pogonomyrmex californicus*)、大頭蟻(*Pheidole megacephala*)、天鵝絨蟻(*Dasymutilla occidentalis*)、熊蜂屬(*Bombus spp.*)、鱗狀黃胡蜂(*Vespula squamosa*)、普通黃蜂(*Paravespula vulgaris*)、西部黃蜂(*Paravespula pennsylvanica*)、德國胡蜂(*Paravespula germanica*)、白麵長黃胡蜂(*Dolichovespula maculata*)、黃邊胡蜂(*Vespa crabro*)、白翅葉蟬(*Polistes rubiginosa*)、木蟻(*Campodontus floridanus*)及阿根廷螞蟻(*Linepithema humile*)；

蟋蟀、蚱蜢、蝗蟲(直翅目(*Orthoptera*))，例如家蟋蟀(*Acheta domestica*)、歐洲螻蛄(*Gryllotalpa gryllotalpa*)、飛蝗(*Locusta migratoria*)、雙帶蚱蜢(*Melanoplus bivittatus*)、赤腿蚱蜢(*Melanoplus femurrubrum*)、墨西哥蚱蜢(*Melanoplus mexicanus*)、遷徙蚱蜢(*Melanoplus sanguinipes*)、落磯山蚱蜢(*Melanoplus spretus*)、紅翅蝗(*Nomadacris septemfasciata*)、美洲蚱蜢(*Schistocerca americana*)、沙漠蝗(*Schistocerca gregaria*)、摩洛哥戟紋蝗(*Dociostaurus maroccanus*)、溫室蟋蟲(*Tachycines asynamorus*)、塞內加爾小車蝗(*Oedaleus senegalensis*)、臭腹腺蝗(*Zonozerus variegatus*)、稻蝗(*Hieroglyphus daganensis*)、角蝗(*Kraussaria angulifera*)、意大利蝗(*Calliptamus italicus*)、澳大利亞災蝗(*Chortoicetes terminifera*)及褐蝗(*Locustana pardalina*)；

蛛形綱(*Arachnoidea*)，諸如蜘蛛類動物(蜱蟎目(*Acarina*))，例如軟蜱科(*Argasidae*)、蜱科(*Ixodidae*)及疥蟎科(*Sarcoptidae*)，諸如美洲花蜱(*Amblyomma americanum*)、彩飾花蜱(*Amblyomma variegatum*)、斑花蜱(*Amblyomma maculatum*)、波斯隱喙蜱(*Argas persicus*)、具環方頭蜱(*Boophilus annulatus*)、消色牛蜱(*Boophilus decoloratus*)、微小牛蜱(*Boophilus microplus*)、森林革蜱(*Dermacentor silvarum*)、安氏革蜱(*Dermacentor andersoni*)、變異革蜱(*Dermacentor variabilis*)、長緣璃眼蜱(*Hyalomma truncatum*)、蓖籽硬蜱(*Ixodes ricinus*)、淺紅硬蜱(*Ixodes rubicundus*)、黑腳硬蜱(*Ixodes scapularis*)、全環硬蜱(*Ixodes holocyclus*)、太平洋硬蜱(*Ixodes pacificus*)、非洲鈍緣蜱(*Ornithodorus moubata*)、赫姆鈍緣蜱(*Ornithodorus hermsi*)、回歸熱鈍緣蜱(*Ornithodorus turicata*)、柏氏禽刺蟎(*Ornithonyssus bacoti*)、耳殘喙蜱(*Otobius megnini*)、雞皮刺蟎(*Dermanyssus gallinae*)、羊癢蟎(*Psoroptes ovis*)、血紅扇頭蜱(*Rhipicephalus sanguineus*)、具尾扇頭蜱(*Rhipicephalus appendiculatus*)、紅腳扇頭蜱(*Rhipicephalus evertsi*)、疥蟎(*Sarcoptes scabiei*)；及癭蟎科(*Eriophyidae spp.*)，諸如蘋刺癭蟎(*Aculus schlechtendali*)、橘鏽蟎(*Phyllocoptrata oleivora*)及柑桔癭蟎(*Eriophyes sheldoni*)；跗線蟎科(*Tarsonemidae spp.*)，諸如仙客來蟎(*Phytonemus pallidus*)及多食跗線蟎(*Polyphagotarsonemus latus*)；細鬚蟎科(*Tenuipalpidae spp.*)，諸如紫紅短鬚蟎(*Brevipalpus*

phoenicis)；葉蟎科(*Tetranychidae spp.*)，諸如朱砂葉蟎(*Tetranychus cinnabarinus*)、神澤氏葉蟎(*Tetranychus kanzawai*)、太平洋紅葉蟎(*Tetranychus pacificus*)、棉紅葉蟎(*Tetranychus telarius*)及棉葉蟎(*Tetranychus urticae*)、蘋果紅蜘蛛(*Panonychus ulmi*)、橘全爪蟎(*Panonychus citri*)及草地小瓜蟎(*Oligonychus pratensis*)；蜘蛛目(*Araneida*)，例如黑寡婦蜘蛛(*Latrodectus mactans*)及棕色隱遁蜘蛛(*Loxosceles reclusa*)；

跳蚤(蚤目(*Siphonaptera*))，例如貓蚤(*Ctenocephalides felis*)、犬蚤(*Ctenocephalides canis*)、印度鼠蚤(*Xenopsylla cheopis*)、人蚤(*Pulex irritans*)、穿皮潛蚤(*Tunga penetrans*)及條紋鼠蚤(*Nosopsyllus fasciatus*)；

蠹蟲、家衣魚(纓尾目(*Thysanura*))，例如西洋衣魚(*Lepisma saccharina*)及小灶衣魚(*Thermobia domestica*)；

蜈蚣(唇足綱(*Chilopoda*))，例如蚰蜒(*Scutigera coleoptrata*)；

千足蟲(倍足綱(*Diplopoda*))，例如山蛩屬(*Narceus spp.*)；

蠼螋(革翅目(*Dermaptera*))，例如，歐洲球螋(*forficula auricularia*)；

虱(虱目(*Phthiraptera*))，例如人頭蝨(*Pediculus humanus capitis*)、人體虱(*Pediculus humanus corporis*)、恥陰虱(*Pthirus pubis*)、牛血虱(*Haematopinus eurysternus*)、豬血虱(*Haematopinus suis*)、牛顎虱(*Linognathus vituli*)、牛鳥虱(*Bovicola bovis*)、雞虱(*Menopon gallinae*)、大雞虱(*Menacanthus stramineus*)及牛管虱(*Solenopotes capillatus*)；

彈尾目(*Collembola*)(跳蟲)，例如棘跳蟲亞種(*Onychiurus ssp.*)。

式I化合物亦適合於控制線蟲：植物寄生性線蟲，諸如根結線蟲類，北方根結線蟲(*Meloidogyne hapla*)、南方根結線蟲(*Meloidogyne incognita*)、爪哇根結線蟲(*Meloidogyne javanica*)及其他根結線蟲屬(*Meloidogyne species*)；成囊線蟲類，馬鈴薯金線蟲(*Globodera rostochiensis*)及其他金線蟲屬(*Globodera species*)、小麥胞囊線蟲(*Heterodera avenae*)、大豆胞囊線蟲(*Heterodera glycines*)、甜菜胞囊線蟲(*Heterodera schachtii*)、三葉草胞囊線蟲(*Heterodera trifolii*)及其他胞囊線蟲屬(*Heterodera species*)；種子蟲癭線蟲類，粒線蟲屬(*Anguina species*)；莖及葉線蟲類，滑刃線蟲屬(*Aphelenchoides species*)；刺線蟲類，刺線蟲(*Belonolaimus longicaudatus*)及其他刺線蟲屬(*Belonolaimus species*)；松線蟲類，松材線蟲(*Bursaphelenchus xylophilus*)及其他傘滑刃線蟲屬(*Bursaphelenchus species*)；環線蟲類，環紋線蟲屬(*Criconema species*)、小環線蟲屬(*Criconemella species*)、似環線蟲屬(*Criconemoides species*)、中環線蟲屬(*Mesocriconema species*)；莖及球莖線蟲類，馬鈴薯腐爛莖線蟲(*Ditylenchus destructor*)、玉米莖線蟲(*Ditylenchus dipsaci*)及其他雙墊刃屬(*Ditylenchus species*)；錐線蟲類，錐線蟲屬(*Dolichodorus species*)；螺旋線蟲類，多環螺旋線蟲(*Helicotylenchus multicinctus*)及其他螺旋線蟲屬

(*Helicotylenchus species*)；外鞘線蟲類及鞘線蟲類，鞘線蟲屬(*Hemicycliophora species*)及半輪線蟲屬(*Hemicriconemoides species*)；潛根線蟲屬(*Hirschmanniella species*)；矛線蟲類，冠線蟲屬(*Hoplolaimus species*)；假根瘤線蟲類，珍珠線蟲屬(*Nacobbus species*)；針線蟲類，伸長長針線蟲(*Longidorus elongates*)及其他長針線蟲屬(*Longidorus species*)；腐線蟲類，落選短體線蟲(*Pratylenchus neglectus*)、北方根腐線蟲(*Pratylenchus penetrans*)、彎曲根腐線蟲(*Pratylenchus curvitatus*)、損傷根腐線蟲(*Pratylenchus goodeyi*)及其他草地墊刃線蟲屬(*Pratylenchus species*)；掘穴線蟲類，香蕉穿孔線蟲(*Radopholus similis*)及其他內侵線蟲屬(*Radopholus species*)；腎形線蟲類，強壯盤旋線蟲(*Rotylenchus robustus*)及其他盤旋線蟲屬(*Rotylenchus species*)；螺旋線蟲屬(*Scutellonema species*)；殘根線蟲類，克伯氏殘根線蟲(*Trichodorus primitivus*)及其他毛刺線蟲屬(*Trichodorus species*)、擬毛刺線蟲(*Paratrichodorus species*)；矮化線蟲類，克萊頓矮化線蟲(*Tylenchorhynchus claytoni*)、不定矮化線蟲(*Tylenchorhynchus dubius*)及其他矮化線蟲屬(*Tylenchorhynchus species*)；柑橘線蟲類，墊刃線蟲屬(*Tylenchulus species*)；劍線蟲類，劍線蟲屬(*Xiphinema species*)；及其他植物寄生性線蟲物種。

式I化合物及其鹽亦適用於控制蜘蛛類動物(蛛形綱)，諸如蜱蟎(蜱蟎目)，例如軟蜱科、蜱科及疥蟎科，諸如美洲花蜱、彩飾花蜱、波斯隱喙蜱、具環方頭蜱、消色牛蜱、

微小牛蜱、森林革蜱、長喙璃眼蜱、蓖籽硬蜱、淺紅硬蜱、非洲鈍喙蜱、耳殘喙蜱、雞皮刺蟎、羊癢蟎、具尾扇頭蜱、紅腳扇頭蜱、疥蟎；及瘿蟎科，諸如蘋刺瘿蟎、橘鏽蟎及柑桔瘿蟎；跗線蟎科，諸如仙客來蟎及多食跗線蟎；細鬚蟎科，諸如紫紅短鬚蟎；葉蟎科，諸如朱砂葉蟎、神澤氏葉蟎、太平洋紅葉蟎、棉紅葉蟎及棉葉蟎、蘋果紅蜘蛛、橘全爪蟎及草地小瓜蟎。

式I化合物尤其適用於控制昆蟲，較佳吸啜式或刺吸式昆蟲，諸如來自纓翅目、雙翅目及半翅目之昆蟲，尤其來自以下屬之昆蟲：

纓翅目：菸草褐薊馬、苜蓿薊馬、花薊馬、橘實薊馬、稻薊馬、南黃薊馬及菸薊馬；

雙翅目，例如埃及伊蚊、白紋伊蚊、刺擾伊蚊、墨西哥橘實蠅、五斑按蚊、災難按蚊、白足按蚊、瘧蚊、弗氏按蚊、白踝按蚊、微小按蚊、四斑按蚊、紅頭麗蠅、地中海實蠅、蛆症金蠅、美洲金蠅、美洲稻水蠅、鹿蠅、靜斑虻、大西洋黃虻、螺旋蠅、高樑瘿蚊、盾波蠅、狂怒庫蠓、五帶淡色庫蚊、環紋庫蚊、熱帶家蚊、媒斑蚊、冬蚊、黑尾睞毛蚊、瓜實蠅、油橄欖實蠅、芸苔莢瘿蚊、蔥蠅、麥種蠅、種蠅、甘藍地種蠅、人膚蠅、黃腹廄蠅、馬鈴薯禾蠅、大馬胃蠅、刺舌蠅、鬚舌蠅、引舌蠅、膠舌蠅、騷擾角蠅、蝴蝶蘭潛蠅、潛蠅屬、種蠅、紋皮蠅、急流細蠓、美洲斑潛蠅、三葉斑潛蠅、山羊綠蠅、銅綠蠅、絲光綠蠅、白楊花蠅、替特納孟松蚊、黑森麥桿蠅、秋家

蠅、家蠅、廄腐蠅、羊鼻蠅、黃禾蠅、瑞典麥稈蠅、甜菜潛葉蠅、洋蔥蠅、甘藍蠅、麥種蠅、安氏白蛉、哥倫比亞壞血蚊、胡蘿蔔蠅、變色鱗蚊、混合原蚋、櫻桃實蠅、蘋果實蠅、紅尾肉蠅、麻蠅屬、帶蚋、廄螯蠅、牛虻、北美黑虻、條紋虻及擬馬虻、甘藍大蚊及歐洲大蚊；

半翅目，尤其蚜蟲：紅豆草無網長管蚜、落葉松球蚜、鼠李馬鈴薯蚜、蠶豆蚜、草莓根蚜、蘋果蚜、棉蚜、醋栗蚜、鼠李蚜、繡線菊蚜、接骨木蚜、豌豆蚜、馬鈴薯長鬚蚜、薊短尾蚜、光管舌尾蚜、桃黑短尾蚜、梅蚜、甘藍蚜、角釘毛蚜、方翅網蝽、草莓釘蚜、茶蕉隱瘤額蚜、諾曼尼椎球蚜、冷杉椎球蚜、根瘤蚜、蘋果溝無網蚜、蘋粉紅劣蚜、梨樹篷子蚜、蠶豆微葉蟬、梅大尾蚜、茶蕉苦菜蚜、麥長管蚜、大戟長管蚜、薔薇長管蚜、蠶豆修尾蚜、梨草蚜、薔薇麥蚜、桃蚜、冬蔥蚜、櫻桃黑瘤額蚜、桃捲葉蚜、萵苣蚜、褐稻虱、囊柄癭綿蚜、蔗飛虱、蛇麻疣額蚜、蘋木虱、梨木虱、冬蔥縊瘤蚜、玉米縊管蚜、禾穀縊管蚜、蘋草縊管蚜、馬萊圓尾蚜、馬里圓尾蚜、麥二叉蚜、榆梨綿蚜、麥長管蚜、溫室白粉虱、大桔蚜及葡萄根瘤蚜；

式I化合物尤其適用於控制半翅目及纓翅目之昆蟲。

調配物

為在本發明之方法中使用，化合物I可轉化為習用調配物，例如溶液、乳液、懸浮液、粉劑、散劑、糊劑、顆粒及可直接噴灑溶液。使用形式視特定目的及施用方法而

定。選擇調配物及施用方法以確保在各種狀況下本發明之式I化合物的精細及均勻分布。

調配物係以已知方式製備(關於評論，參見(例如)US 3,060,084；EP-A 707 445(關於液體濃縮物)；Browning,「Agglomeration」, Chemical Engineering, 1967年12月4日，147-48；Perry's Chemical Engineer's Handbook，第4版，McGraw-Hill, New York, 1963，第8-57頁及以下各頁；WO 91/13546；US 4,172,714；US 4,144,050；US 3,920,442；US 5,180,587；US 5,232,701；US 5,208,030；GB 2,095,558；US 3,299,566；Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961；Hance等人，Weed Control Handbook，第8版，Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989；及Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Germany), 2001, 2；D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8))，例如，藉由向活性化合物中摻入適合於調配農用化學品之助劑，諸如溶劑及/或載劑，必要時摻入乳化劑、界面活性劑及分散劑、防腐劑、消泡劑、防凍劑，對於種子處理調配物而言亦視情況摻入著色劑及/或黏合劑及/或膠凝劑。

合適之溶劑/載劑為(例如)：

- 溶劑，諸如水、芳族溶劑(例如Solvesso產品、二甲苯及其類似物)、石蠟(例如礦物餾份)、醇(例如甲醇、丁

醇、戊醇、苯甲醇)、酮(例如環己酮、γ-丁內酯)、吡咯啶酮(N-甲基-吡咯啶酮(NMP)、N-辛基吡咯啶酮(NOP))、乙酸酯(乙二醇二乙酸酯)、乳酸烷酯、內酯(諸如g-丁內酯)、二醇、脂肪酸二甲基醯胺、脂肪酸及脂肪酸酯、甘油三酯、植物或動物來源之油及諸如烷基化植物油之改質油。原則上亦可使用溶劑混合物。

- 載劑，諸如經研磨之天然礦物及經研磨之合成礦物，諸如矽膠、細粉狀矽酸、矽酸鹽、滑石、高嶺土、美國活性白土(attaclay)、石灰石、石灰、白堊、紅玄武土、黃土、黏土、白雲石、矽藻土、硫酸鈣及硫酸鎂、氧化鎂、經研磨之合成材料、肥料(諸如硫酸銨、磷酸銨、硝酸銨、尿素)及植物來源之產品(諸如穀類粗粉、樹皮粗粉、木材粗粉及堅果殼粗粉、纖維素粉末)及其他固體載劑。

合適之乳化劑為非離子型及陰離子型乳化劑(例如聚氧乙烯脂肪醇醚、烷基磺酸鹽及芳基磺酸鹽)。

分散劑之實例為木質素亞硫酸鹽廢液及甲基纖維素。

合適之界面活性劑為木質磺酸、萘磺酸、酚磺酸、二丁基萘磺酸之鹼金屬、鹼土金屬及銨鹽；烷基芳基磺酸鹽、烷基硫酸鹽、烷基磺酸鹽、脂肪醇硫酸鹽、脂肪酸及硫酸化脂肪醇二醇醚；此外為磺化萘及萘衍生物與甲醛之縮合物、萘或萘磺酸與苯酚及甲醛之縮合物、聚氧乙烯辛基苯基醚、乙氧基化異辛基酚、辛基酚、壬基酚、烷基苯基聚乙二醇醚、三丁基苯基聚乙二醇醚、三硬脂醯基苯基聚乙

二醇醚、烷基芳基聚醚醇、醇及脂肪醇/氧化乙烯縮合物、乙氧基化蓖麻油、聚氧乙烯烷基醚、乙氧基化聚氧丙烯、月桂醇聚乙二醇醚縮醛、山梨糖醇酯。

亦可將防凍劑(諸如甘油、乙二醇、丙二醇)及殺菌劑添加至調配物中。

適合之消泡劑為例如基於矽或硬脂酸鎂之消泡劑。

適合之防腐劑為例如二氯酚及苯甲醇半縮甲醛。

適合之增稠劑為賦予調配物假塑性流動行為(亦即靜止時具有高黏度且在攪動階段中具有低黏度)之化合物。在本文中可提及例如基於多醣之市售增稠劑，諸如Xanthan Gum®(Kelco之Kelzan®)、Rhodopol® 23(Rhone Poulenc)或Veegum®(R.T. Vanderbilt)，或有機葉狀矽酸鹽，諸如Attaclay®(Engelhardt)。適合本發明分散液的消泡劑為例如聚矽氧乳液(諸如Rhodia之Silikon® SRE、Wacker或Rhodorsil®)、長鏈醇、脂肪酸、有機氟化合物及其混合物。可添加殺生物劑以穩定本發明組合物來對抗微生物之侵襲。適合之殺生物劑係例如基於異噻唑酮，諸如Avecia(或Arch)以商標Proxel®或Thor Chemie以商標Acticide® RS及Rohm & Haas以商標Kathon® MK出售之化合物。適合之防凍劑為有機多元醇，例如乙二醇、丙二醇或甘油。此等物質通常以活性化合物組合物之總重量計不大於10重量%之量使用。若適當，本發明之活性化合物組合物可包含所製備之調配物之總量計1重量%至5重量%之緩衝劑以調節pH，所用緩衝劑之量及類型視活性化合物之

化學特性而定。緩衝劑之實例為諸如磷酸、硼酸、乙酸、丙酸、檸檬酸、反丁烯二酸、酒石酸、草酸及丁二酸之弱無機或有機酸之鹼金屬鹽。

適於製備可直接噴灑溶液、乳液、糊劑或油性分散液之物質為中至高沸點之礦物油餾份，諸如煤油或柴油；此外煤焦油及植物或動物來源之油；脂族烴、環烴及芳族烴，例如甲苯、二甲苯、石蠟、四氫萘、烷基化萘或其衍生物；甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、環己醇、環己酮、異佛爾酮；強極性溶劑，例如二甲亞碸、N-甲基吡咯啶酮及水。

散劑、撒布物質及粉劑可藉由活性物質與固體載劑混合或共同研磨來製備。

顆粒，例如包衣顆粒、浸漬顆粒及均質顆粒，可藉由活性成份與固體載劑結合來製備。固體載劑之實例為礦土，諸如矽膠、矽酸鹽、滑石、高嶺土、美國活性白土(attaclay)、石灰石、石灰、白堊、紅玄武土(bole)、黃土、黏土、白雲石、矽藻土、硫酸鈣、硫酸鎂、氧化鎂、經研磨之合成材料；肥料，諸如硫酸銨、磷酸銨、硝酸銨、尿素；及植物來源之產品，諸如穀類粗粉、樹皮粗粉、木材粗粉及堅果殼粗粉、纖維素粉末；及其他固體載劑。

一般而言，調配物包含0.01重量%至95重量%、較佳0.1重量%至90重量%之活性成份。活性成份係以90%至100%、較佳95%至100%之純度(根據NMR光譜)使用。

出於種子處理之目的，可將各別調配物稀釋2-10倍以在即用製劑中產生以活性化合物重量計0.01重量%至60重量

%、較佳0.1重量%至40重量%之濃度。

式I化合物可以如所指之其調配物形式或由此製備之使用形式，例如以直接可噴灑溶液、散劑、懸浮液或分散液、乳液、油性分散液、糊劑、可粉化產品、撒布用物質或顆粒之形式，藉助於噴灑、霧化、粉化、撒布或傾倒而使用。使用形式完全視預期目的而定；其意欲確保在各種狀況下使本發明之活性化合物儘可能最精細地分布。

以下為調配物之實例：

1. 以水稀釋之產品。出於種子處理之目的，該等產品可經稀釋或未經稀釋而施用於種子。

A) 水溶性濃縮物(SL、LS)

將10重量份活性化合物溶解於90重量份水或水溶性溶劑中。作為替代，添加濕潤劑或其他助劑。以水稀釋後，活性化合物溶解，藉以獲得具有10% (w/w)活性化合物之調配物。

B) 可分散濃縮物(DC)

在添加10重量份分散劑(例如聚乙烯吡咯啶酮)下，將20重量份活性化合物溶解於70重量份環己酮中。以水稀釋得到分散液，藉以獲得具有20% (w/w)活性化合物之調配物。

C) 可乳化濃縮物(EC)

在添加十二烷基苯磺酸鈣及乙氧基化蓖麻油(在各種狀況下為5重量份)下，將15重量份活性化合物溶解於7重量份二甲苯中。以水稀釋得到乳液，藉以獲得具有15%

(w/w)活性化合物之調配物。

D) 乳液(EW、EO、ES)

在添加十二烷基苯磺酸鈣及乙氧基化蓖麻油(在各種狀況下為5重量份)下，將25重量份活性化合物溶解於35重量份二甲苯中。藉助於乳化機(例如Ultraturrax)將此混合物引入30重量份水中且將其製成均質乳液。以水稀釋得到乳液，藉以獲得具有25% (w/w)活性化合物之調配物。

E) 懸浮液(SC、OD、FS)

在攪動式球磨機中，在添加10重量份分散劑、濕潤劑及70重量份水或有機溶劑下將20重量份活性化合物磨碎以得到精細活性化合物懸浮液。以水稀釋得到活性化合物之穩定懸浮液，藉以獲得具有20% (w/w)活性化合物之調配物。

F) 水分散性顆粒及水溶性顆粒(WG、SG)

在添加50重量份分散劑及濕潤劑下將50重量份活性化合物精細研磨且藉助於技術設備(例如擠壓機、噴霧塔、流化床)製成水分散性或水溶性顆粒。以水稀釋得到活性化合物之穩定分散液或溶液，藉以獲得具有50% (w/w)活性化合物之調配物。

G) 水分散性散劑及水溶性散劑(WP、SP、SS、WS)

在轉子-定子研磨機中於添加25重量份分散劑、濕潤劑及矽膠下研磨75重量份活性化合物。以水稀釋得到活性化合物之穩定分散液或溶液，藉以獲得具有75% (w/w)活性化合物之調配物。

H) 凝膠調配物(GF)

在攪動式球磨機中，在添加10重量份分散劑、1重量份膠凝劑濕潤劑及70重量份水或有機溶劑下將20重量份活性化合物磨碎以得到精細活性化合物懸浮液。以水稀釋得到活性化合物之穩定懸浮液，藉以獲得具有20% (w/w)活性化合物之調配物。

2. 未經稀釋而施用於葉面之產品。出於種子處理之目的，該等產品可經稀釋或未經稀釋而施用於種子。

I) 可粉化散劑(DP、DS)

將5重量份活性化合物精細研磨且與95重量份細粉狀高嶺土緊密混合。此得到具有5% (w/w)活性化合物之可粉化產品。

J) 顆粒(GR、FG、GG、MG)

將0.5重量份活性化合物精細研磨且與95.5重量份載劑締合，藉以獲得具有0.5% (w/w)活性化合物之調配物。當前方法為擠出、噴霧乾燥或流化床。此得到未經稀釋而施用於葉面之顆粒。

K) ULV溶液(UL)

將10重量份活性化合物溶解於90重量份有機溶劑(例如二甲苯)中。此得到具有10% (w/w)活性化合物之產品，其未經稀釋而施用於葉面。

可藉由添加水而自乳液濃縮物、糊劑或可濕潤散劑(可噴灑散劑、油性分散液)來製備水性使用形式。為製備乳液、糊劑或油性分散液，可藉助於濕潤劑、增黏劑、分散

劑或乳化劑使原樣或溶解於油或溶劑中之物質在水中均質化。或者，可能製備包含活性物質、濕潤劑、增黏劑、分散劑或乳化劑及(適當時)溶劑或油之濃縮物，且該等濃縮物適合於以水稀釋。

即用產品中之活性成份濃度可在相對寬的範圍內變化。一般而言，其為0.0001%至10%，較佳為0.01%至1%。

活性成份亦可成功地用於超低容量方法(ULV)中，可能施用包含超過95重量%之活性成份的調配物，或甚至可能在無添加劑之情況下施用活性成份。

在本發明之方法中，化合物I可與其他活性成份一起施用，例如與其他殺蟲劑、殺昆蟲劑、除草劑、肥料(諸如硝酸銨、尿素、鉀鹼及過磷酸鹽)、植物毒素及植物生長調節劑、安全劑及殺線蟲劑一起施用。此等其他成份可依序使用或與上文所述之組合物組合使用，適當時，亦僅在臨用前添加(桶混製劑)。舉例而言，植物可在用其他活性成份處理之前或之後用本發明之組合物噴灑。

本發明之化合物可與之一起使用且可能與之產生潛在協同效應之殺蟲劑的以下清單M意欲說明可能組合，但不強加任何限制：

M.1.有機(硫代)磷酸酯：歐殺松(acephate)、甲基吡唑磷(azamethiphos)、益棉磷(azinphos-ethyl)、穀硫磷(azinphos-methyl)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、毒蟲畏(chlorfenvinphos)、氯甲硫磷(chlormephos)、毒死蜱(chlorpyrifos)、甲基毒死蜱(chlorpyrifos-methyl)、蠅毒磷

(coumaphos)、殺螟腈(cyanophos)、甲基內吸磷(demeton-S-methyl)、大利松(diazinon)、敵敵畏(dichlorvos)/DDVP、雙特松(dicrotophos)、大滅松(dimethoate)、甲基毒蟲畏(dimethylvinphos)、乙拌磷(disulfoton)、EPN、乙硫磷(ethion)、普伏松(ethoprophos)、伐滅磷(famphur)、苯線磷(fenamiphos)、殺螟硫磷(fenitrothion)、倍硫磷(fenthion)、吡氟硫磷(flupyrazophos)、噻唑硫磷(fosthiazate)、庚烯磷(heptenophos)、異噁唑磷(isoxathion)、馬拉硫磷(malathion)、滅蚜磷(mecarbam)、甲胺磷(methamidophos)、滅大松(methidathion)、速滅磷(mevinphos)、久效磷(monocrotophos)、二溴磷(naled)、氧樂果(omethoate)、滅多松(oxydemeton-methyl)、對硫磷(parathion)、甲基對硫磷(parathion-methyl)、賽達松(phenthoate)、甲拌磷(phorate)、伏殺磷(phosalone)、亞胺硫磷(phosmet)、磷胺(phosphamidon)、巴賽松(phoxim)、甲基嘧啶磷(pirimiphos-methyl)、丙溴磷(profenofos)、胺丙畏(propetamphos)、丙硫磷(prothiofos)、吡唑硫磷(pyraclofos)、噠嗪硫磷(pyridaphenthion)、喹硫磷(quinalphos)、硫特普(sulfotep)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、雙硫磷(temephos)、託福松(terbufos)、殺蟲畏(tetrachlorvinphos)、硫滅松(thiometon)、三落松(triazophos)、三氯松(trichlorfon)、繁米松(vamidothion)；

M.2.胺基甲酸酯：得滅克(aldicarb)、阿蘭克(alanycarb)、免敵克(bendiocarb)、免扶克(benfuracarb)、丁酮威(butocarboxim)、丁酮碸威(butoxycarboxim)、加保利

(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、丁基加保扶(carbosulfan)、乙硫苯威(ethiofencarb)、丁基滅必虱(fenobucarb)、覆滅蟎(formetanate)、夫硫克(furathiocarb)、滅必虱(isoprocarb)、滅蟲威(methiocarb)、納乃得(methomyl)、治滅虱(metolcarb)、歐殺滅(oxamyl)、比加普(pirimicarb)、安丹(propoxur)、硫地克(thiodicarb)、久效威(thiofanox)、混殺威(trimethacarb)、XMC、滅殺威(xylylcarb)、唑蚜威(triazamate)；

M.3.擬除蟲菊酯(pyrethroid)：阿納寧(acrinathrin)、亞列寧(allethrin)、d-順反式亞列寧、d-反式亞列寧、畢芬寧(bifenthrin)、百亞列寧(bioallethrin)、S-環戊烯基百亞列寧(bioallethrin S-cylclopentenyl)、百列滅寧(bioresmethrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、β-賽扶寧(beta-cyfluthrin)、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、ξ-賽滅寧、賽酚寧(cyphenothrin)、第滅寧(deltamethrin)、益避寧(empenthrin)、益化利(esfenvalerate)、依芬寧(etofenprox)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、護賽寧(flucythrinate)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、τ-福化利(tau-fluvalinate)、合芬寧(halfenprox)、依普寧(imiprothrin)、美特寧(metofluthrin)、百滅寧(permethrin)、酚丁滅虱(phenothrin)、普亞列寧(prallethrin)、丙氟菊酯(profluthrin)、除蟲菊精(pyrethrin)(除蟲菊屬(pyrethrum)))、異列滅寧(resmethrin)、西拉福芬(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin)、

胺菊酯(tetramethrin)、四溴菊酯(tralomethrin)、四氟苯菊酯(transfluthrin)；

M.4.保幼激素模擬物：烯蟲乙酯(hydroprene)、烯蟲炔酯(kinoprene)、烯蟲酯(methoprene)、芬氧克(fenoxycarb)、百利普芬(pyriproxyfen)；

M.5.菸鹼受體促效劑/拮抗劑化合物：啶蟲咪(acetamiprid)、殺蟲磺(bensultap)、鹽酸培丹(cartap hydrochloride)、可尼丁(clothianidin)、呋蟲胺(dinotefuran)、吡蟲啉(imidacloprid)、噻蟲嗪(thiamethoxam)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、菸鹼、賜諾殺(spinosad)(別位促效劑)、蘋果和梨內(spinetoram)(別位促效劑)、噻蟲啉(thiacloprid)、殺蟲環(thiocyclam)、殺蟲雙(thiosultap-sodium)及AKD1022；

M.6. GABA閘控氯離子通道拮抗劑化合物：氯丹(chlordane)、硫丹(endosulfan)、林丹(γ-HCH/lindane)、乙蟲清(ethiprole)、費普尼(fipronil)、比氟普爾(pyrafluprole)、比普爾(pyriprole)；

M.7.氯離子通道活化劑：阿巴汀(abamectin)、因滅汀苯甲酸鹽(emamectin benzoate)、密滅汀(milbemectin)、萊披菌素(lepimectin)；

M.8. METI I化合物：喹螨醚(fenazaquin)、芬普螨(fenpyroximate)、嘧螨醚(pyrimidifen)、比達本(pyridaben)、吡螨胺(tebufenpyrad)、唑蟲醯胺(tolfenpyrad)、啼蟲胺(flufenerim)、魚藤精(rotenone)；

M.9. METI II及III化合物：亞醌螨(acequinocyl)、伏克

咪(fluacyprim)、伏蟻腙(hydramethylnon)；

M.10.氧化磷酸化解偶合劑：蟲螨腈(chlorfenapyr)、DNOC；

M.11.氧化磷酸化抑制劑：三唑錫(azocyclotin)、三環錫(cyhexatin)、殺螨隆(diafenthiuron)、苯丁錫(fenbutatin oxide)、克螨特(propargite)、三氯殺螨碸(tetradifon)；

M.12.蛻皮破壞劑：賽滅淨(cyromazine)、環蟲醯肼(chromafenozide)、氯蟲醯肼(halofenozide)、甲氧蟲醯肼(methoxyfenozide)、蟲醯肼(tebufenozide)；

M.13.增效劑：增效醚(piperonyl butoxide)、脫葉磷(tribufos)；

M.14.鈉通道阻斷劑化合物：茚蟲威(indoxacarb)、氰氟蟲腙(metaflumizone)；

M.15.燻蒸劑：甲基溴、氯化苦(chloropicrin)、硫醯氟；

M.16.選擇性攝食阻斷劑：克洛汰(crylotie)、吡蚜酮(pymetrozine)、氟啶蟲醯胺(flonicamid)；

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

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

得福隆(teflubenzuron)、殺蟲隆(triflumuron)；

M.19.脂質生物合成抑制劑：螺蟎酯(spirodiclofen)、螺甲蟎酯(spiromesifen)、螺蟲乙酯(spirotetramat)；

M.20.奧克巴胺能促效劑(octapaminergic agonist)：雙甲脒(amitraz)；

M.21.雷諾定(ryanodine)受體調節劑：氟蟲醯胺(flubendiamide)、(R)-3-氯-N1-{2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基}-N2-(1-甲基-2-甲基磺醯基乙基)鄰苯二甲醯胺、(S)-3-氯-N1-{2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基}-N2-(1-甲基-2-甲基磺醯基乙基)鄰苯二甲醯胺(M21.1)；

M.22.各種殺蟲劑：磷化鋁、胺氟美特(amidoflumet)、苯氯噻嗪(benclothiaz)、苯蟎特(benzoximate)、聯苯肼酯(bifenazate)、硼砂(borax)、溴蟎酯(bromopropylate)、氰化物、殺蟎劑(cyenopyrafen)、丁氟蟎酯(cyflumetofen)、滅蟎猛(chinomethionate)、三氯殺蟎醇(dicofol)、氟乙酸酯、膦、啶蟲丙醚(pyridalyl)、吡氟喹唑(pyrifluquinazon)、硫、有機硫化合物、吐酒石(tartar emetic)、磺克伏(sulfoxaflor)、4-丁-2-炔氧基-6-(3,5-二甲基-哌啶-1-基)-2-氟-嘧啶(M22.1)、3-苯甲醯基胺基-N-[2,6-二甲基-4-(1,2,2,2-四氟-1-三氟甲基-乙基)-苯基]-2-氟-苯甲醯胺(M22.2)、4-[5-(3,5-二氯-苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫-異噁唑-3-基]-2-甲基-N-吡啶-2-基甲基-苯甲醯胺(M22.3)、4-[5-(3,5-二氯-苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫-異噁唑-3-基]-2-

甲基-N-(2,2,2-三氟-乙基)-苯甲醯胺(M22.4)、4-[5-(3,5-二氯-苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫-異噁唑-3-基]-2-甲基-N-噻唑-2-基甲基-苯甲醯胺(M22.5)、4-[5-(3,5-二氯-苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫-異噁唑-3-基]-2-甲基-N-(四氫-呋喃-2-基甲基)-苯甲醯胺(M22.6)、4-{[(6-溴吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M22.7)、4-{[(6-氟吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M22.8)、4-{[(2-氯-1,3-噻唑-5-基)甲基](2-氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M22.9)、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M22.10)、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M22.11)、4-{[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](甲基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M22.12)、4-{[(5,6-二氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮((M22.13)、4-{[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](環丙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M22.14)、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](環丙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M22.15)、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](甲基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M22.16)、環丙烷乙酸、1,1'-[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-4-[[(2-環丙基乙醯基)氧基]甲基]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氫-12-羥基-4,6a,12b-三甲基-11-側氧基-9-(3-吡啶基)-2H,11H-萘幷[2,1-b]哌喃幷[3,4-e]哌喃-3,6-二基]酯(M22.17)、8-(2-環丙基甲氧基-4-甲基-苯氧基)-3-(6-甲基-噠嗪-3-基)-3-氮雜-雙環[3.2.1]辛烷(M22.18)；

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

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

M.24.鄰胺基苯甲醯胺(anthranilamide)：氯蟲醯胺(chlorantraniliprole)、氰蟲醯胺(cyantraniliprole)、5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[4-氰基-2-(1-環丙基-乙基胺甲醯基)-6-甲基-苯基]-醯胺(M24.1)、5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[2-氯-4-氰基-6-(1-環丙基-乙基胺甲醯基)-苯基]-醯胺(M24.2)、5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[2-溴-4-氰基-6-(1-環丙基-乙基胺甲醯基)-苯基]-醯胺(M24.3)、5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[2-溴-4-氯-6-(1-環丙基-乙基胺甲醯基)-苯基]-醯胺(M24.4)、5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[2,4-二氯-6-(1-環丙基-乙基胺甲醯基)-苯基]-醯胺(M24.5)、5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[4-氯-2-(1-環丙基-乙基胺甲醯基)-6-甲基-苯基]-醯胺(M24.6)；

M.25.丙二腈化合物：$CF_2HCF_2CF_2CF_2CH_2C(CN)_2CH_2CH_2CF_3$、(2-(2,2,3,3,4,4,5,5-八氟戊基)-2-(3,3,3-三氟-丙基)丙二腈)、$CF_2HCF_2CF_2CF_2CH_2C(CN)_2CH_2CH_2CF_2CF_3$、(2-(2,2,3,3,4,4,5,5-八氟戊基)-2-(3,3,4,4,4-五氟丁基)-丙二腈)；

M.26.微生物破壞劑：蘇雲金芽孢桿菌以色列亞種(*Bacillus thuringiensis subsp. Israelensi*)、球形芽孢桿菌(*Bacillus sphaericus*)、蘇雲金芽孢桿菌鯰澤亞種(*Bacillus*

thuringiensis subsp. Aizawai)、蘇雲金芽孢桿菌庫斯塔克亞種(*Bacillus thuringiensis subsp. Kurstaki*)、蘇雲金桿芽孢菌擬步行甲亞種(*Bacillus thuringiensis subsp. Tenebrionis*)；

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

萊披菌素獲知於Agro Project, PJB Publications Ltd, 2004年11月中。苯氯噻嗪及其製備已描述於EP-A1 454621中。滅大松及對氧磷(Paraoxon)及其製備已描述於Farm Chemicals Handbook，第88卷，Meister Publishing Company, 2001中。氰氟蟲腙及其製備已描述於EP-A1 462 456中。吡氟硫磷(flupyrazofos)已描述於Pesticide Science 54, 1988，第237-243頁及US 4822779中。比氟普爾及其製備已描述於JP 2002193709及WO 01/00614中。比普爾及其製備已描述於WO 98/45274及US 6335357中。胺氟美特及其製備已描述於US 6221890及JP 21010907中。啼蟲胺及其製備已描述於WO 03/007717及WO 03/007718中。AKD 1022及其製備已描述於US 6300348中。氯蟲醯胺已描述於WO 01/70671、WO 03/015519及WO 05/118552中。氰蟲醯胺已描述於WO 01/70671、WO 04/067528及WO 05/118552中。鄰胺基苯甲醯胺M24.1至M24.6已描述於WO 2008/72743及WO 200872783中。鄰苯二甲醯胺M21.1獲知於WO 2007/101540中。丁氟螨酯及其製備已描述於WO 04/080180中。胺基喹唑啉酮化合物吡氟喹唑已描述於EP A 109 7932中。磺醯亞胺類磺克伏已

描述於WO 2006/060029及WO 2007/149134中。炔基醚化合物M22.1描述於(例如)JP 2006131529中。有機硫化合物已描述於WO 2007060839中。甲醯胺化合物M22.2獲知於WO 2007/83394中。噁唑啉化合物M22.3至M22.6已描述於WO 2007/074789中。呋喃酮(furanon)化合物M22.7至M22.16已描述於(例如)WO 2007/115644中。吡普芬(pyripyropene)衍生物M22.17已描述於WO 2008/66153及WO 2008/108491中。噠嗪化合物M22.18已描述於JP 2008/115155中。丙二腈化合物已描述於WO 02/089579、WO 02/090320、WO 02/090321、WO 04/006677、WO 05/068423、WO 05/068432及WO 05/063694中。

殺真菌混合搭配物為選自由以下各物組成之群的彼等搭配物：

醯基丙胺酸，諸如苯霜靈(benalaxyl)、滅達樂(metalaxyl)、呋醯胺(ofurace)、歐殺斯(oxadixyl)；

胺衍生物，諸如阿迪嗎啉(aldimorph)、多寧(dodine)、嗎菌靈(dodemorph)、粉鏽啉(fenpropimorph)、苯鏽啶(fenpropidin)、雙胍鹽(guazatine)、雙胍辛胺(iminoctadine)、螺環菌胺(spiroxamin)、三得芬(tridemorph)；

苯胺基嘧啶，諸如嘧黴胺(pyrimethanil)、嘧菌胺(mepanipyrim)或嘧菌環胺(cyprodinil)；

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

唑，諸如比多農(bitertanol)、溴克唑(bromoconazole)、環克座(cyproconazole)、苯醚甲環唑(difenoconazole)、二硝基克唑(dinitroconazole)、氟環唑(epoxiconazole)、腈苯唑(fenbuconazole)、氟奎康唑(fluquinconazole)、護矽得(flusilazole)、己唑醇(hexaconazole)、依滅列(imazalil)、葉菌唑(metconazole)、邁克尼(myclobutanil)、平克座(penconazole)、普克利(propiconazole)、咪醯胺(prochloraz)、丙硫醇克唑(prothioconazole)、得克利(tebuconazole)、三泰芬(triadimefon)、三泰隆(triadimenol)、賽福座(triflumizol)、環菌唑(triticonazole)、粉唑醇(flutriafol)；

二甲醯亞胺，諸如依普同(iprodion)、米克啉(myclozolin)、撲滅寧(procymidon)、免克寧(vinclozolin)；

二硫代胺基甲酸酯，諸如福美鐵(ferbam)、代森鈉(nabam)、錳乃浦(maneb)、錳粉克(mancozeb)、美坦(metam)、免得爛(metiram)、甲基鋅乃浦(propineb)、聚胺基甲酸酯、得恩地(thiram)、益穗(ziram)、鋅乃浦(zineb)；

雜環化合物，諸如敵菌靈(anilazine)、免賴得(benomyl)、博克利(boscalid)、貝芬替(carbendazim)、萎鏽靈(carboxin)、氧化萎鏽靈(oxycarboxin)、賽座滅(cyazofamid)、邁隆(dazomet)、二硫二氰蒽醌(dithianon)、噁唑菌酮(famoxadon)、咪唑菌酮(fenamidon)、芬瑞莫(fenarimol)、麥穗靈(fuberidazole)、氟多寧(flutolanil)、福拉比(furametpyr)、稻瘟靈(isoprothiolane)、滅鏽胺

(mepronil)、氟苯嘧啶醇(nuarimol)、噻菌靈(probenazole)、普奎那茲(proquinazid)、比芬諾(pyrifenox)、百快隆(pyroquilon)、快諾芬(quinoxyfen)、矽硫芬(silthiofam)、噻苯咪唑(thiabendazole)、賽氟滅(thifluzamid)、甲基多保淨(thiophanate-methyl)、汰敵寧(tiadinil)、三賽唑(tricyclazole)、賽福寧(triforine)；

銅殺真菌劑，諸如波爾多混合物(Bordeaux mixture)、乙酸銅、鹼性氯氧化銅、鹼式硫酸銅；

硝基苯基衍生物，諸如百螨克(binapacryl)、白粉克(dinocap)、大脫螨(dinobuton)、硝基鄰苯二甲酸異丙基(nitrophthalisopropyl)；

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

硫；

其他殺真菌劑，諸如酸化苯并噻二唑-S-甲酯(acibenzolar-S-methyl)、苯噻瓦利(benthiavalicarb)、加普胺(carpropamid)、四氯異苯腈(chlorothalonil)、噻芬胺(cyflufenamid)、霜脲氰(cymoxanil)、噠菌清(diclomezin)、二氯西莫(diclocymet)、乙黴威(diethofencarb)、護粒松(edifen-phos)、乙噻博胺(ethaboxam)、環醯菌胺(fenhexamid)、三苯醋錫(fentin-acetate)、禾草靈(fenoxanil)、嘧菌腙(ferimzone)、扶吉胺(fluazinam)、福賽得(fosetyl)、乙磷鋁(fosetyl-aluminum)、纈黴威(iprovalicarb)、六氯苯(hexachlorobenzene)、美曲芬諾(metrafenon)、賓克隆(pencycuron)、霜黴威(propamocarb)、苯酞(phthalide)、脫

克松(tolclofos-methyl)、奎脫辛(quintozene)、氯苯醯胺(zoxamid)；

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

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

肉桂醯胺及類似物，諸如達滅芬(dimethomorph)、氟美醯胺(flumetover)或氟嗎啉(flumorph)。

施用

可藉由此項技術中已知之任何施用方法使動物害蟲(亦即，昆蟲、蜘蛛類動物及線蟲)、植物、植物正於其中生長之土壤或水與本發明之式I化合物或含有其之組合物接觸。就此而言，「接觸」包括直接接觸(將化合物/組合物直接施用於動物害蟲或植物(通常植物之葉、莖或根)上)與間接接觸(將化合物/組合物施用於動物害蟲或植物之所在地)。

式I化合物或包含其之殺蟲組合物可藉由使植物/作物與殺蟲有效量之式I化合物接觸而用於保護生長中之植物及作物免遭動物害蟲，尤其昆蟲、粉蟎或蜘蛛類動物侵襲或侵染。術語「作物」係指生長中及已收穫之作物。

本發明之化合物及包含其之組合物對控制各種栽培植物上之眾多昆蟲而言尤其重要，該等栽培植物為諸如穀類、塊根作物、油料作物、蔬菜、香料作物、觀賞植物，例如以下各物之種子：硬質小麥及其他小麥、大麥、燕麥、黑麥、玉米(飼料玉米及糖玉米/甜玉米及普通玉米)、大豆、油料作物、十字花科植物、棉花、向日葵、香蕉、水稻、油菜、蕪菁油菜、甜菜、飼料甜菜、茄子、馬鈴薯、草、草坪、草皮、飼草、番茄、韭菜、南瓜(pumpkin/squash)、甘藍菜、捲心萵苣、胡椒、黃瓜、甜瓜、芸苔屬(Brassica species)、甜瓜、蠶豆、豌豆、大蒜、洋蔥、胡蘿蔔、諸如馬鈴薯之塊莖植物、甘蔗、菸草、葡萄、矮牽牛、天竺葵(geranium/pelargonium)、三色堇及鳳仙花。

藉由用殺昆蟲有效量之活性化合物處理昆蟲或欲加以保護以免遭昆蟲侵襲之植物、植物繁殖材料(諸如種子、土壤、表面、材料或場所)來按原樣或以組合物形式使用本發明之化合物。在植物、植物繁殖材料(諸如種子、土壤、表面、材料或場所)遭昆蟲感染之前與之後均可進行施用。

本發明亦包括一種對抗動物害蟲之方法，其包含使動物害蟲，其棲息地，滋生地，食物來源，該等動物害蟲正於其中生長或可能於其中生長之栽培植物、種子、土壤、區域、材料或環境，或欲加以保護以免遭動物侵襲或侵染之材料、植物、種子、土壤、表面或空間與殺蟲有效量之至少一種活性化合物I之混合物接觸。

此外，可藉由使目標害蟲、其食物來源、棲息地、滋生地或其所在地與殺蟲有效量之式I化合物接觸來控制動物害蟲。就此而言，可在所在地、生長中之作物或已收穫之作物遭害蟲感染之前或之後進行施用。

本發明之化合物亦可預防性地施用於預期出現害蟲之位置。

式I化合物亦可藉由使植物與殺蟲有效量之式I化合物接觸而用於保護生長中之植物免遭害蟲侵襲或侵染。就此而言，「接觸」包括直接接觸(將化合物/組合物直接施用於害蟲及/或植物(通常植物之葉、莖或根)上)與間接接觸(將化合物/組合物施用於害蟲及/或植物之所在地)。

「所在地」意謂害蟲或寄生蟲正於其中生長或可能於其中生長之棲息地、滋生地、植物、種子、土壤、區域、材料或環境。

術語「植物繁殖材料」應理解為表示可用於植物繁殖之所有植物生殖性部分(諸如種子)及生長性植物材料(諸如插枝及塊莖)(例如馬鈴薯)。此植物繁殖材料包括植物之種子、根、果實、塊莖、球莖、根莖、嫩芽、幼枝及其他部分。亦可包括在萌芽後或露出土壤後將移植之幼苗及幼年植物。可在種植或移植之時或之前用植物保護化合物預防性地處理此等植物繁殖材料。

術語「栽培植物」應理解為包括已藉由育種、誘變或遺傳工程化而修飾之植物。經遺傳修飾之植物為遺傳物質已藉由使用重組DNA技術修飾之植物，該等植物在天然情況

下不易於藉由雜交育種、突變或天然重組獲得。通常，已將一或多個基因整合至經遺傳修飾之植物的遺傳物質中以改良植物之某些特性。該等遺傳修飾亦包括(但不限於)(例如)藉由糖基化或聚合物添加(諸如異戊烯化、乙醯化或法呢基化部分或PEG部分)進行蛋白質(寡肽或多肽)之靶向轉譯後修飾(例如，如Biotechnol Prog. 2001年7月-8月；17(4):720-8；Protein Eng Des Sel. 2004年1月；17(1):57-66；Nat Protoc. 2007; 2(5):1225-35；Curr Opin Chem Biol. 2006年10月；10(5):487-91；Epub 2006年8月28日；Biomaterials. 2001年3月；22(5):405-17；Bioconjug Chem. 2005年1月-2月；16(1):113-21中所揭示)。

術語「栽培植物」應理解為亦包括由於習知育種或遺傳工程化方法已對特定類別之除草劑之施用產生耐受性的植物，該等除草劑為諸如羥基苯基丙酮酸二加氧酶(HPPD)抑制劑；乙醯乳酸合成酶(ALS)抑制劑，諸如磺醯脲(參見，例如US 6,222,100、WO 01/82685、WO 00/26390、WO 97/41218、WO 98/02526、WO 98/02527、WO 04/106529、WO 05/20673、WO 03/14357、WO 03/13225、WO 03/14356、WO 04/16073)或咪唑啉酮(參見，例如US 6,222,100、WO 01/82685、WO 00/26390、WO 97/41218、WO 98/02526、WO 98/02527、WO 04/106529、WO 05/20673、WO 03/14357、WO 03/13225、WO 03/14356、WO 04/16073)；烯醇丙酮醯莽草酸-3-磷酸合成酶(enolpyruvylshikimate-3-phosphate synthase，EPSPS)抑制劑，諸如草甘膦(glyphosate)(參見，例如WO 92/00377)；

麩醯胺酸合成酶(GS)抑制劑，諸如草胺膦(glufosinate)(參見，例如EP-A-0242236、EP-A-242246)；或氧寧(oxynil)除草劑(參見，例如US 5,559,024)。若干栽培植物已藉由習知育種(誘變)方法而對除草劑產生耐受性，例如，Clearfield®夏季油菜(卡諾拉(Canola))對咪唑啉酮(例如甲氧咪草菸(imazamox))具耐受性。遺傳工程化方法已用於使諸如大豆、棉花、玉米、甜菜及油菜之栽培植物對除草劑具耐受性，該等除草劑諸如草甘膦及草胺膦，其中一些以商標名RoundupReady®(草甘膦)及LibertyLink®(草胺膦)市售可得。

術語「栽培植物」應理解為亦包括藉由使用重組DNA技術而能夠合成一或多種殺昆蟲蛋白之植物，尤其已知來自細菌桿菌屬(*Bacillus*)、尤其來自蘇雲金芽孢桿菌(*Bacillus thuringiensis*)之彼等蛋白，諸如ä-內毒素，例如CryIA(b)、CryIA(c)、CryIF、CryIF(a2)、CryIIA(b)、CryIIIA、CryIIIB(b1)或Cry9c；營養期殺昆蟲蛋白(VIP)，例如VIP1、VIP2、VIP3或VIP3A；定殖線蟲之細菌(例如發光桿菌屬(*Photorhabdus spp.*)或嗜線蟲致病桿菌屬(*Xenorhabdus spp.*))之殺昆蟲蛋白；由動物產生之毒素，諸如蠍毒素、蜘蛛毒素、黃蜂毒素或其他昆蟲特異性神經毒素；由真菌產生之毒素，諸如鏈黴菌毒素(Streptomycetes toxin)；植物凝血素，諸如豌豆或大麥凝血素；凝集素；蛋白酶抑制劑，諸如胰蛋白酶抑制劑、絲胺酸蛋白酶抑制劑、塊莖儲藏蛋白(patatin)抑制劑、半胱胺酸蛋白酶抑制劑(cystatin)或木瓜蛋白酶抑制

劑；核糖體失活蛋白(RIP)，諸如蓖麻毒素(ricin)、玉米-RIP、相思子毒素(abrin)、絲瓜籽毒蛋白(luffin)、沙泊寧(saporin)或異株腹瀉毒蛋白(bryodin)；類固醇代謝酶，諸如3-羥基類固醇氧化酶、蛻皮類固醇-IDP-糖基轉移酶、膽固醇氧化酶、蛻皮激素抑制劑或HMG-CoA還原酶；離子通道阻斷劑，諸如鈉通道阻斷劑或鈣通道阻斷劑；保幼激素酯酶；利尿激素受體(異株瀉根毒蛋白受體(helicokinin receptor))；芪合成酶、聯苄合成酶、殼多糖酶(chitinase)或葡聚糖酶(glucanase)。在本發明之上下文中，此等殺昆蟲蛋白或毒素亦清楚地理解為原毒素(pre-toxin)、雜交蛋白、截短或以其他方式修飾之蛋白。雜交蛋白之特徵在於新穎蛋白域組合(參見，例如WO 02/015701)。該等毒素或能夠合成該等毒素之經遺傳修飾之植物的其他實例揭示於(例如)EP-A 374 753、WO 93/007278、WO 95/34656、EP-A 427 529、EP-A 451 878、WO 03/018810及WO 03/052073中。產生該等經遺傳修飾之植物的方法一般為熟習此項技術者所知且描述於(例如)上文所提及之公開案中。經遺傳修飾之植物中所含之此等殺昆蟲蛋白給予產生此等蛋白之植物以保護而免遭來自某些節肢動物分類群之有害害蟲、尤其甲蟲(鞘翅目)、蠅(雙翅目)及蝴蝶及蛾(鱗翅目)及植物寄生性線蟲(線蟲綱(Nematoda))的侵害。

術語「栽培植物」應理解為亦包括藉由使用重組DNA技術而能夠合成一或多種蛋白質以增加彼等植物對細菌、病毒或真菌病原體之抗性或耐受性的植物。該等蛋白質之實

例為所謂「病原相關蛋白」(PR蛋白，參見，例如EP-A 0 392 225)、植物抗病基因(例如馬鈴薯栽培品種，其表現源自墨西哥野生馬鈴薯二倍體品種(*Solanum bulbocastanum*)之對致病疫黴(*Phytophthora infestans*)起作用的抗性基因)或T4-溶菌酶(T4-lyso-zym)(例如能夠合成此等蛋白質而使得對諸如梨火疫病病原菌(*Erwinia amylovora*)之細菌的抗性增加之馬鈴薯栽培品種)。產生該等經遺傳修飾之植物的方法一般為熟習此項技術者所知且描述於(例如)上文所提及之公開案中。

術語「栽培植物」應理解為亦包括藉由使用重組DNA技術而能夠合成一或多種蛋白質以增加彼等植物之生產力(例如生物質量產生、穀粒產量、澱粉含量、油含量或蛋白質含量)，對乾旱、鹽度或其他生長限制性環境因素之耐受性或對害蟲及真菌、細菌或病毒病原體之耐受性的植物。

術語「栽培植物」應理解為亦包括藉由使用重組DNA技術而含有經改變量之內含物質或新穎內含物質以特定地改良人或動物營養之植物，例如產生促進健康之長鏈ω-3脂肪酸或不飽和ω-9脂肪酸之油料作物(例如Nexera®油菜)。

術語「栽培植物」應理解為亦包括藉由使用重組DNA技術而含有經改變量之內含物質或新穎內含物質以特定地改良原料產生之植物，例如產生增加量之支鏈澱粉(amylopectin)的馬鈴薯(例如Amflora®馬鈴薯)。

一般而言，「殺蟲有效量」意謂達成對生長之可觀測作

用所需的活性成份之量，該等作用包括壞死、死亡、延遲、預防及移除、破壞或以其他方式減少目標有機體出現及活性的作用。對於本發明所用之各種化合物/組合物而言，殺蟲有效量可不同。組合物之殺蟲有效量亦將根據主要條件而變，該等條件為諸如所要殺蟲作用及持續時間、天氣、目標物種、所在地、施用模式及其類似條件。

在土壤處理之狀況下或在施用於害蟲居住地或巢穴之狀況下，活性成份之量處於每100平方公尺0.0001公克至500公克、較佳每100平方公尺0.001公克至20公克之範圍內。

材料保護中之習用施用率為(例如)每平方公尺處理材料0.01公克至1000公克活性化合物，理想地為每平方公尺0.1公克至50公克。

用於材料浸漬之殺昆蟲組合物通常含有0.001重量%至95重量%、較佳0.1重量%至45重量%且更佳1重量%至25重量%之至少一種拒避劑及/或殺昆蟲劑。

對於在處理作物植物中使用而言，本發明之活性成份之施用率可在每公頃0.1公克至4000公克、理想地在每公頃25公克至600公克、更理想地在每公頃50公克至500公克之範圍內。

式I化合物係經接觸(經由土壤、玻璃、牆、床帳、地毯、植物部分或動物部分)與攝取(誘餌或植物部分)而有效。

亦可施用本發明之化合物以對抗非作物昆蟲害蟲，諸如螞蟻、白蟻、黃蜂、蠅、蚊、蟋蟀或蟑螂。為用於對抗該

等非作物害蟲，式I化合物較佳以誘餌組合物形式使用。

誘餌可為液體、固體或半固體製劑(例如凝膠)。固體誘餌可形成適合於各別施用之各種形狀及形式，例如顆粒、塊狀物、棍狀物、盤狀物。液體誘餌可填充至確保適當施用之各種裝置中，該等裝置為例如開口容器、噴霧裝置、液滴源或蒸發源。凝膠可基於水性或油性基質且可根據黏性、保水性或老化特徵方面之特定需要進行調配。

組合物中所用之誘餌為具有充分吸引力以誘使諸如螞蟻、白蟻、黃蜂、蠅、蚊、蟋蟀或蟑螂等之昆蟲來食用其之產品。吸引力可藉由使用攝食刺激物或性信息素來操縱。食物刺激物係(例如，但並非排他地)選自動物及/或植物蛋白(肉粉、魚粉或血粉、昆蟲部分、蛋黃)，動物及/或植物來源之脂肪及油，或單有機醣、寡有機醣或多有機醣，尤其選自蔗糖、乳糖、果糖、右旋糖、葡萄糖、澱粉、果膠或甚至糖蜜或蜂蜜。果實、作物、植物、動物、昆蟲或其特定部分之新鮮或腐敗部分亦可充當攝食刺激物。已知性信息素對昆蟲更具特異性。特異性信息素描述於文獻中且為熟習此項技術者所知。

對於在誘餌組合物中使用而言，活性成份之典型含量為0.001重量%至15重量%，理想地為0.001重量%至5%重量%之活性化合物。

呈氣霧劑(例如於噴霧罐中)、油噴霧或泵噴霧形式之式I化合物的調配物極其適合於非專業使用者來控制諸如蠅、跳蚤、壁虱、蚊或蟑螂之害蟲。氣霧劑配方較佳包含活性

化合物；溶劑，諸如低級醇(例如甲醇、乙醇、丙醇、丁醇)、酮(例如丙酮、甲基乙基酮)、具有約50℃至250℃之沸點範圍的石蠟烴(例如煤油)、二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯啶酮、二甲亞碸、芳族烴(諸如甲苯、二甲苯)、水；此外包含助劑，諸如乳化劑(諸如山梨糖醇單油酸酯、具有3-7 mol氧化乙烯之油基乙氧化物、脂肪醇乙氧化物)、諸如香精油之香料油、中等脂肪酸與低級醇之酯、芳族羰基化合物，適當時，諸如苯甲酸鈉之穩定劑、兩性界面活性劑、低級環氧化物、原甲酸三乙酯，及必要時，諸如丙烷、丁烷、氮氣、壓縮空氣、二甲醚、二氧化碳、氧化亞氮或此等氣體之混合物的推進劑。

油噴霧調配物與氣霧劑配方之不同之處在於不使用推進劑。

對於在噴霧組合物中使用而言，活性成份之含量為0.001重量%至80重量%，較佳0.01重量%至50重量%且最佳0.01重量%至15重量%。

式I化合物及其各別組合物亦可用於蚊香及薰香、煙筒、汽化器板或長期汽化器中以及防蛀紙、防蛀墊或其他不依賴熱之汽化器系統中。

用式I化合物及其各別組合物控制由昆蟲傳播之傳染病(例如瘧疾、登革熱(dengue fever)及黃熱病、淋巴絲蟲病及利什曼病(leishmaniasis))的方法亦包含處理棚屋及房屋之表面、空氣噴霧及浸漬窗簾、帳篷、成衣製品、床帳、捕舌蠅器或其類似物。施用於纖維、織物、針織品、非織

品、網狀材料或箔片及防水布之殺昆蟲組合物較佳包含包括殺昆蟲劑、視情況拒避劑及至少一種黏合劑之混合物。合適之拒避劑為(例如)N,N-二乙基-間甲苯醯胺(DEET)；N,N-二乙基苯基乙醯胺(DEPA)；1-(3-環己-1-基-羰基)-2-甲基胡椒鹼；(2-羥基甲基環己基)乙酸內酯；2-乙基-1,3-己二醇；避蚊酮(indalone)；甲基新癸醯胺(MNDA)；並非用於昆蟲控制之擬除蟲菊酯，諸如{(+/-)-3-烯丙基-2-甲基-4-側氧基環戊-2-(+)-烯基-(+)-反-菊酸酯(賜百寧(Esbiothrin))；源自植物提取物或與植物提取物相同之拒避劑，該等植物提取物如檸檬烯、丁香酚、(+)-優卡醇(Eucamalol)(1)、(-)-1-表優卡醇；或來自植物之粗植物提取物的拒避劑，該等提取物如檸檬桉(*Eucalyptus maculata*)、白背蔓荊(*Vitex rotundifolia*)、馬丁香茅(*Cymbopogon martinii*)、檸檬香茅(*Cymbopogon citratus*)(檸檬草)、香水香茅(*Cymbopogon nardus*)(香茅)。合適之黏合劑係選自(例如)以下者之聚合物及共聚物：脂族酸之乙烯酯(諸如乙酸乙烯酯及維吾爾酸乙烯酯)、醇之丙烯酸酯及甲基丙烯酸酯(諸如丙烯酸丁酯、丙烯酸2-乙基己酯及丙烯酸甲酯)、單烯系不飽和烴及二烯系不飽和烴(諸如苯乙烯)及脂族二烯(諸如丁二烯)。

窗簾及床帳之浸漬一般係藉由將紡織材料浸入殺昆蟲劑之乳液或分散液中或將殺昆蟲劑之乳液或分散液噴灑至帳上來完成。

式I化合物及其組合物可用於保護諸如樹、木柵欄、枕

木等之木製材料，及諸如房屋、外屋、工廠之建築物，以及建築材料、傢具、皮革、纖維、乙烯基物品、電線及電纜等，以免遭螞蟻及/或白蟻侵害，且用於控制螞蟻及白蟻防止其對作物或人類產生危害(例如，當害蟲侵入房屋及公共設施時)。式I化合物不僅施用於周圍土壤表面或施用於地下土壤中以保護木製材料，而且其亦可施用於諸如地下混凝土之表面、床柱、橫樑、膠合板、傢具等之製材物品，諸如粒片板、半板等之木製品及諸如經塗布電線、乙烯基薄板之乙烯基物品，諸如苯乙烯發泡體之絕熱材料等。在施用以對抗對作物或人類產生危害之螞蟻的狀況下，將本發明之螞蟻控制劑施用於作物或周圍土壤，或直接施用於螞蟻之巢穴或其類似物。

種子處理

式I化合物亦適合於處理種子以保護種子免遭昆蟲害蟲、尤其土生昆蟲害蟲侵害且保護所得植物之根及嫩芽免遭土壤害蟲及葉片昆蟲侵害。

式I化合物尤其適用於保護種子免遭土壤害蟲侵害且保護所得植物之根及嫩芽免遭土壤害蟲及葉片昆蟲侵害。保護所得植物之根及嫩芽為較佳的。更佳為保護所得植物之嫩芽免遭刺吸式及吸啜式昆蟲侵害，其中保護其免遭蚜蟲侵害為最佳的。

因此，本發明包含一種保護種子免遭昆蟲、尤其土壤昆蟲侵害且保護幼苗之根及嫩芽免遭昆蟲、尤其土壤及葉片昆蟲侵害之方法，該方法包含使該等種子在播種前及/或

催芽後與通式I之化合物或其鹽接觸。尤其較佳為一種保護植物之根及嫩芽的方法，更佳為一種保護植物嫩芽免遭刺吸式及吸啜式昆蟲侵害之方法，最佳為一種保護植物嫩芽免遭蚜蟲侵害之方法。

術語種子涵蓋所有種類之種子及植物繁殖體，包括(但不限於)實生種子、插條、吸根、球根、球莖、果實、塊莖、穀粒、插枝、伐條及其類似物且在一較佳實施例中意謂實生種子。

術語種子處理包含此項技術中已知之所有合適之種子處理技術，諸如拌種(seed dressing)、種子包衣(seed coating)、種子噴粉(seed dusting)、浸種(seed soaking)及種子丸化(seed pelleting)。

本發明亦包含用活性化合物包衣之種子或含有活性化合物之種子。

術語「包衣及/或含有」一般表示在施用時活性成份大部分處於繁殖產物之表面上，儘管視施用方法而定，較多或較少部分之成份可穿透至繁殖產物中。當(重新)種植該繁殖產物時，其可吸收活性成份。

合適之種子為穀類、塊根作物、油料作物、蔬菜、香料作物、觀賞植物之種子，例如以下各物之種子：硬質小麥及其他小麥、大麥、燕麥、黑麥、玉米(飼料玉米及糖玉米/甜玉米及普通玉米)、大豆、油料作物、十字花科植物、棉花、向日葵、香蕉、水稻、油菜、蕪菁油菜、甜菜、飼料甜菜、茄子、馬鈴薯、草、草坪、草皮、飼草、

番茄、韭菜、南瓜、甘藍菜、捲心萵苣、胡椒、黃瓜、甜瓜、芸苔屬、甜瓜、蠶豆、豌豆、大蒜、洋蔥、胡蘿蔔、諸如馬鈴薯之塊莖植物、甘蔗、菸草、葡萄、矮牽牛、天竺葵、三色堇及鳳仙花。

另外，活性化合物亦可用於處理來自植物之種子，該等植物由於包括遺傳工程化方法之育種而耐受除草劑或殺真菌劑或殺昆蟲劑之作用。

舉例而言，活性化合物可用於處理對來自由以下各物組成之群之除草劑具抗性的植物種子：磺醯脲、咪唑啉酮、草銨膦 (glufosinate-ammonium) 或草甘膦異丙銨 (glyphosate-isopropylammonium)及類似活性物質(參見，例如EP-A-0242236、EP-A-242246)(WO 92/00377)(EP-A-0257993、美國專利第5,013,659號)或用於轉殖基因作物植物，例如能夠產生使植物對某些害蟲具抗性之蘇雲金芽孢桿菌毒素(Bt毒素)的棉花(EP-A-0142924、EP-A-0193259)。

此外，活性化合物亦可用於處理植物之種子，該等植物與現有植物相比具有改變之特徵，其可(例如)藉由傳統育種方法及/或產生突變體或藉由重組程序而產生。舉例而言，已描述出於修飾植物中所合成之澱粉的目的而對作物植物進行重組修飾之許多狀況(例如WO 92/11376、WO 92/14827、WO 91/19806)或已描述具有經改變之脂肪酸組成的轉殖基因作物植物之許多狀況(WO 91/13972)。

活性化合物之種子處理施用係藉由在植物播種之前及植物萌芽之前噴霧或撒種子來進行。

尤其適用於種子處理之組合物為(例如)：

A　可溶性濃縮物(SL、LS)

D　乳液(EW、EO、ES)

E　懸浮液(SC、OD、FS)

F　水分散性顆粒及水溶性顆粒(WG、SG)

G　水分散性散劑及水溶性散劑(WP、SP、WS)

H　凝膠調配物(GF)

I　可粉化散劑(DP、DS)

習知種子處理調配物包括(例如)可流動濃縮物FS、溶液LS、乾式處理用散劑DS、漿料處理用水分散性散劑WS、水溶性散劑SS及乳液ES與EC及凝膠調配物GF。此等調配物可經稀釋或未經稀釋而施用於種子。施用於種子係可在播種之前直接於種子上進行或在已催芽後較晚進行。

在一較佳實施例中，FS調配物用於種子處理。通常，FS調配物可包含1-800 g/l活性成份、1-200 g/l界面活性劑、0至200 g/l防凍劑、0至400 g/l黏合劑、0至200 g/l顏料及至多1公升溶劑，較佳為水。

用於種子處理之式I化合物之尤其較佳FS調配物通常包含0.1重量%至80重量%(1 g/l至800 g/l)活性成份、0.1重量%至20重量%(1 g/l至200 g/l)至少一種界面活性劑、例如0.05重量%至5重量%濕潤劑及0.5重量%至15重量%分散劑、至多20重量%(例如5%至20%)防凍劑、0至15重量%(例如1重量%至15重量%)顏料及/或染料、0至40重量%(例如1重量%至40重量%)黏合劑(黏附劑/黏著劑)、視情況至多5

重量%(例如0.1重量%至5重量%)增稠劑、視情況0.1%至2%消泡劑，及視情況例如0.01重量%至1重量%之量的防腐劑(諸如殺生物劑、抗氧化劑或其類似物)，及至多100重量%之填充劑/媒劑。

種子處理調配物可另外亦包含黏合劑及視情況著色劑。

可添加黏合劑以改良處理後活性物質於種子上之黏著性。合適之黏合劑為氧化烯(如氧化乙烯或氧化丙烯)之均聚物及共聚物、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇、聚乙烯吡咯啶酮及其共聚物、乙烯-乙酸乙烯酯共聚物、丙烯酸系均聚物及共聚物、聚乙烯胺、聚乙烯醯胺及聚乙烯亞胺、多醣(如纖維素、甲基纖維素(tylose)及澱粉)、聚烯烴均聚物及共聚物(如烯烴/順丁烯二酸酐共聚物)、聚胺基甲酸酯、聚酯、聚苯乙烯均聚物及共聚物。

視情況，著色劑亦可包括於調配物中。用於種子處理調配物之合適著色劑或染料為若丹明B(Rhodamin B)、C.I.顏料紅112、C.I.溶劑紅1、顏料藍15:4、顏料藍15:3、顏料藍15:2、顏料藍15:1、顏料藍80、顏料黃1、顏料黃13、顏料紅112、顏料紅48:2、顏料紅48:1、顏料紅57:1、顏料紅53:1、顏料橙43、顏料橙34、顏料橙5、顏料綠36、顏料綠7、顏料白6、顏料棕25、鹼性紫10、鹼性紫49、酸性紅51、酸性紅52、酸性紅14、酸性藍9、酸性黃23、鹼性紅10、鹼性紅108。

膠凝劑之實例為角叉菜(Satiagel®)。

在種子處理中，化合物I之施用率一般為每100公斤種子

0.1公克至10公斤，較佳為每100公斤種子1公克至5公斤，更佳為每100公斤種子1公克至1000公克且尤其為每100公斤種子1公克至200公克。

因此，本發明亦係關於包含如本文所定義之式I化合物或I之農業上適用之鹽的種子。化合物I或其農業上適用之鹽的量一般將在每100公斤種子0.1公克至10公斤、較佳每100公斤種子1公克至5公斤、尤其每100公斤種子1公克至1000公克之間變化。對於諸如萬苣之特定作物而言，施用率可更高。

動物健康

式I化合物或其對映異構體或獸醫學上可接受之鹽尤其亦適用於對抗動物體內及體表之寄生蟲。

因此，本發明之一目的在於亦提供控制動物體內及體表之寄生蟲的新穎方法。本發明之另一目的在於提供用於動物之較安全殺蟲劑。本發明之另一目的在於進一步提供可以低於現有殺蟲劑之劑量使用的用於動物之殺蟲劑。且本發明之另一目的在於提供可提供對寄生蟲之長期殘效控制的用於動物之殺蟲劑。

本發明亦係關於用於對抗動物體內及體表之寄生蟲的含有殺寄生蟲有效量之式I化合物或其對映異構體或獸醫學上可接受之鹽及可接受之載劑的組合物。

本發明亦提供一種用於治療、控制、預防及保護動物以對抗寄生蟲侵染及感染之方法，其包含向該等動物經口、局部或非經腸投與或施用殺寄生蟲有效量之式I化合物或

其對映異構體或獸醫學上可接受之鹽或包含其之組合物。

本發明亦提供一種製備用於治療、控制、預防或保護動物以對抗寄生蟲侵染或感染之組合物的方法，該組合物包含殺寄生蟲有效量之式I化合物或其對映異構體或獸醫學上可接受之鹽或包含其之組合物。

化合物對抗農業害蟲之活性並不表明其適合於控制動物體內及體表之內寄生蟲及外寄生蟲，其要求(例如)在經口施用之狀況下之低非催吐劑量、與動物之代謝相容性、低毒性及安全操作。

令人驚訝的是，現已發現式I化合物適合於對抗動物體內及體表之內寄生蟲及外寄生蟲。

式I化合物或其對映異構體或獸醫學上可接受之鹽及包含其之組合物較佳用於控制及預防包括對溫血動物(包括人類)及魚之動物的侵染及感染。其(例如)適合於控制及預防對以下動物之侵染及感染：諸如畜牛、綿羊、豬、駱駝、鹿、馬、家禽豬、家禽、兔、山羊、狗及貓、水牛、驢、黃鹿及馴鹿之哺乳動物，以及諸如貂、絨鼠及浣熊之毛皮動物，諸如母雞、鵝、火雞及鴨之鳥類及諸如淡水及鹹水魚之魚類(諸如鱒魚、鯉魚及鰻魚)。

式I化合物或其對映異構體或獸醫學上可接受之鹽及包含其之組合物較佳用於控制及預防對家養動物(諸如狗或貓)之侵染及感染。

對溫血動物及魚之侵染包括(但不限於)虱、咬虱、壁虱、鼻蠅、羊蜱蠅、牛蠅、腐蠅、蠅、蠅蛆、恙蟎、蚋、

蚊及跳蚤。

式I化合物或其對映異構體或獸醫學上可接受之鹽及包含其之組合物適合於全身性及/或非全身性地控制外寄生蟲及/或內寄生蟲。其對所有或一些發育階段具活性。

式I化合物尤其適用於對抗外寄生蟲。

式I化合物尤其適用於分別對抗以下目及屬之寄生蟲：

跳蚤(蚤目)，例如貓蚤、犬蚤、印度鼠蚤、人蚤、穿皮潛蚤及條紋鼠蚤；

蟑螂(蜚蠊目)，例如德國小蠊、亞洲蟑螂、美洲大蠊、日本大蠊、棕色大蠊、黑胸大蠊、澳洲大蠊及東方蜚蠊；

蠅、蚊(雙翅目)，例如埃及伊蚊、白紋伊蚊、刺擾伊蚊、墨西哥橘實蠅、五斑按蚊、災難按蚊、白足按蚊、瘧蚊、弗氏按蚊、白踝按蚊、微小按蚊、四斑按蚊、紅頭麗蠅、蛆症金蠅、美洲金蠅、美洲稻水蠅、鹿蠅、靜斑虻、大西洋黃虻、螺旋蠅、盾波蠅、狂怒庫蠓、五帶淡色庫蚊、環紋庫蚊、熱帶家蚊、媒斑蚊、冬蚊、黑尾睞毛蚊、人膚蠅、黃腹廄蠅、大馬胃蠅、刺舌蠅、鬚舌蠅、引舌蠅、膠舌蠅、騷擾角蠅、蝴蝶蘭潛蠅、潛蠅屬、紋皮蠅、急流細蠓、山羊綠蠅、銅綠蠅、絲光綠蠅、白楊花蠅、孟松蚊屬(*Mansonia spp.*)、家蠅、廄腐蠅、羊鼻蠅、安氏白蛉、哥倫比亞壞血蚊、變色鱗蚊、混合原蚋、紅尾肉蠅、麻蠅屬、帶蚋、廄螯蠅、牛虻、北美黑虻、條紋虻及擬馬虻；

虱(虱目)，例如人頭蝨、人體虱、恥陰虱、牛血虱、豬

血虱、牛顎虱、牛鳥虱、雞虱、大雞虱及牛管虱；

壁虱及寄生蜱(寄蜱目(*Parasitiformes*))：壁虱(蜱亞目(*Ixodida*))，例如黑腳硬蜱、全環硬蜱、太平洋硬蜱、棕色犬壁虱(*Rhiphicephalus sanguineus*)、安氏革蜱、變異革蜱、美洲花蜱、斑花蜱、赫姆鈍緣蜱、回歸熱鈍緣蜱；及寄生蜱(革蜱亞目(*Mesostigmata*))，例如柏氏禽刺蜱及雞皮刺蜱；

輻蜱亞目(*Actinedida*)(前氣門亞目(*Prostigmata*))及粉蜱亞目(*Acaridida*)(無氣門亞目(*Astigmata*))，例如蜂盾蜱屬(*Acarapis spp.*)、姬螯蜱屬(*Cheyletiella spp.*)、鳥扇羽蜱屬(*Ornithocheyletia spp.*)、鼠蜱屬(*Myobia spp.*)、羊癢蜱屬(*Psorergates spp.*)、蠕形蜱屬(*Demodex spp.*)、恙蜱屬(*Trombicula spp.*)、聳蜱屬(*Listrophorus spp.*)、毛囊蟲屬(*Acarus spp.*)、食酪蜱屬(*Tyrophagus spp.*)、嗜木蜱屬(*Caloglyphus spp.*)、粉蜱屬(*Hypodectes spp.*)、翼羽蜱屬(*Pterolichus spp.*)、癢蜱屬(*Psoroptes spp.*)、疥癬屬(*Chorioptes spp.*)、耳疥癬屬(*Otodectes spp.*)、疥蜱屬(*Sarcoptes spp.*)、耳蜱屬(*Notoedres spp.*)、疥癬蟲屬(*Knemidocoptes spp.*)、氣囊蜱屬(*Cytodites spp.*)及皮膜蜱屬(*Laminosioptes spp.*)；

臭蟲(異翅目(*Heteropterida*))：溫帶臭蟲、熱帶臭蟲、白頭獵蝽、錐鼻蟲屬、紅腹獵蝽亞種(*Rhodnius ssp.*)、錐蝽亞種(*Panstrongylus ssp.*)及輪背獵蝽；

虱目(*Anoplurida*)，例如血虱屬(*Haematopinus spp.*)、顎

虱屬(*Linognathus spp.*)、人虱屬(*Pediculus spp.*)、陰虱屬(*Phthirus spp.*)及管虱屬(*Solenopotes spp.*)；

嚼虱目(*Mallophagida*)(阿貝絲亞目(*Arnblycerina*)及絲角亞目(*Ischnocerina*))，例如三門虱屬(*Trimenopon spp.*)、雞虱屬(*Menopon spp.*)、鴨虱屬(*Trinoton spp.*)、牛虱屬(*Bovicola spp.*)、維克虱屬(*Werneckiella spp.*)、牛嚼虱屬(*Lepikentron spp.*)、齧毛虱屬(*Trichodectes spp.*)及貓毛虱屬(*Felicola spp.*)；

蛔蟲線蟲綱：

鞭蟲及旋毛蟲(毛管目(*Trichosyringida*))，例如毛形科(*Trichinellidae*)毛線蟲屬(*Trichinella spp.*)、毛首科(*Trichuridae*)鞭蟲屬(*Trichuris spp.*)、毛細線蟲屬(*Capillaria spp.*)；

桿形目(*Rhabditida*)，例如桿絲蟲屬(*Rhabditis spp.*)、擬圓蟲屬(*Strongyloides spp.*)、糞類圓線蟲屬(*Helicephalobus spp.*)；

圓線蟲目(*Strongylida*)，例如圓線蟲屬(*Strongylus spp.*)、鉤口線蟲屬(*Ancylostoma spp.*)、美洲板口線蟲(*Necator americanus*)、仰口線蟲屬(*Bunostomum spp.*)(鉤蟲)、毛圓線蟲屬(*Trichostrongylus spp.*)、撚轉血矛線蟲(*Haemonchus contortus.*)、奧斯特線蟲屬(*Ostertagia spp.*)、古柏線蟲屬(*Cooperia spp.*)、細頸線蟲屬(*Nematodirus spp.*)、網尾線蟲屬(*Dictyocaulus spp.*)、盅口屬(*Cyathostoma spp.*)、食道口屬(*Oesophagostomum spp.*)、豬腎蟲(*Stephanurus*

dentatus)、盤頭線蟲屬(*Ollulanus spp.*)、夏伯特線蟲屬(*Chabertia spp.*)、豬腎蟲、氣管比翼線蟲(*Syngamus trachea*)、鉤口線蟲屬、彎口屬(*Uncinaria spp.*)、球首線蟲屬(*Globocephalus spp.*)、板口線蟲屬(*Necator spp.*)、後圓線蟲屬(*Metastrongylus spp.*)、毛樣繆勒線蟲(*Muellerius capillaris*)、原圓線蟲屬(*Protostrongylus spp.*)、住血線蟲屬(*Angiostrongylus spp.*)、擬馬鹿圓屬(*Parelaphostrongylus spp.*)、貓肺蟲(*Aelurostrongylus abstrusus*)及腎膨結線蟲(*Dioctophyma renale*)；

腸蛔蟲(蛔蟲目(*Ascaridida*))，例如似蚓蛔線蟲(*Ascaris lumbricoides*)、豬蛔蟲(*Ascaris suum*)、雞蛔蟲(*Ascaridia galli*)、馬副蛔蟲(*Parascaris equorum*)、人蟯蟲(*Enterobius vermicularis*)(蟯蟲)、犬弓蛔蟲(*Toxocara canis*)、獅弓蛔蟲(*Toxascaris leonine*)、斯氏線蟲屬(*Skrjabinema spp.*)及馬尖尾線蟲(*Oxyuris equi*)；

駝形目(*Camallanida*)，例如麥地那龍線蟲(*Dracunculus medinensis*，guinea worm)；

旋尾目(*Spirurida*)，例如吸吮線蟲屬(*Thelazia spp.*)、絲蟲屬(*Wuchereria spp.*)、布魯格絲蟲屬(*Brugia spp.*)、盤尾屬(*Onchocerca spp.*)、心絲蟲屬(*Dirofilari spp.*)、雙瓣絲蟲屬(*Dipetalonema spp.*)、絲狀線蟲屬(*Setaria spp.*)、絲絨蟲屬(*Elaeophora spp.*)、狼旋尾線蟲(*Spirocerca lupi*)及柔線屬(*Habronema spp.*)；

棘頭蟲(棘頭蟲綱(*Acanthocephala*))，例如棘頭蟲屬

(*Acanthocephalus spp.*)、豬巨吻棘頭蟲(*Macracanthorhynchus hirudinaceus*)及鉤棘頭蟲屬(*Oncicola spp.*)；

真渦蟲(扁蟲動物門(*Platyhelminthes*))：

吸蟲(吸蟲綱(*Trematoda*))，例如肝吸蟲屬(*Faciola spp.*)、大吸蟲(*Fascioloides magna*)、並殖吸蟲屬(*Paragonimus spp.*)、雙腔吸蟲屬(*Dicrocoelium spp.*)、孛斯基薑片蟲(*Fasciolopsis buski*)、中華肝吸蟲(*Clonorchis sinensis*)、住血吸蟲屬(*Schistosoma spp.*)、毛血吸蟲屬(*Trichobilharzia spp.*)、有翼翼形吸蟲(*Alaria alata*)、並殖吸蟲屬及納吸蟲屬(*Nanocyetes spp.*)；

囊蟲(*Cercomeromorpha*)，尤其條蟲綱(*Cestoda*)(條蟲)，例如裂頭條蟲屬(*Diphyllobothrium spp.*)、條蟲屬(*Tenia spp.*)、胞蟲屬(*Echinococcus spp.*)、大條蟲(*Dipylidium caninum*)、多頭條蟲屬(*Multiceps spp.*)、包膜蟲屬(*Hymenolepis spp.*)、中殖孔條蟲屬(*Mesocestoides spp.*)、膜殼條蟲屬(*Vampirolepis spp.*)、莫尼茨屬(*Moniezia spp.*)、裸頭條蟲屬(*Anoplocephala spp.*)、迭宮條蟲屬(*Sirometra spp.*)、裸頭條蟲屬及包膜條蟲屬(*Hymenolepis spp.*)。

式I化合物及含有其之組合物尤其適用於控制來自雙翅目、蚤目及蜱亞目之害蟲。

此外，使用式I化合物及含有其之組合物對抗蚊類為尤其較佳的。

使用式I化合物及含有其之組合物對抗蠅類為本發明之

另一較佳實施例。

此外，使用式I化合物及含有其之組合物對抗跳蚤為尤其較佳的。

使用式I化合物及含有其之組合物對抗壁虱為本發明之另一較佳實施例。

式I化合物亦尤其適用於對抗內寄生蟲(蛔蟲線蟲綱、棘頭蟲及真渦蟲)。

可進行預防性與治療性投藥。

活性化合物之投藥係直接進行或以合適之製劑形式經口、局部/經皮或非經腸進行。

為經口投與溫血動物，式I化合物可調配成動物飼料、動物飼料預混物、動物飼料濃縮物、丸劑、溶液、糊劑、懸浮液、灌藥、凝膠、錠劑、大丸劑及膠囊。另外，式I化合物可於動物飲用水中投與該等動物。對於經口投藥而言，所選劑型應向動物提供每天每公斤動物體重0.01毫克至100毫克式I化合物，較佳每天每公斤動物體重0.5毫克至100毫克。

或者，式I化合物可非經腸投與動物，例如藉由瘤胃內、肌肉內、靜脈內或皮下注射來投與。式I化合物可分散於或溶解於生理學上可接受之載劑中以供皮下注射。或者，式I化合物可調配成供皮下投藥之植入物。另外，式I化合物可經皮投與動物。對於非經腸投藥而言，所選劑型應向動物提供每天每公斤動物體重0.01毫克至100毫克式I化合物。

式I化合物亦可以浸液、粉劑、散劑、項圈、徽章、噴霧、洗髮精、點滴式及傾倒式調配物之形式及以油膏或水包油或油包水乳液之形式局部施用於動物。對於局部施用而言，浸液及噴霧通常含有0.5 ppm至5,000 ppm且較佳1 ppm至3,000 ppm之式I化合物。另外，式I化合物可調配成耳標以用於動物，尤其用於諸如畜牛及綿羊之四足動物。

合適之製劑為：

- 溶液，諸如口服溶液、稀釋後經口投與之濃縮物、用於皮膚上或體腔內之溶液、傾倒式調配物、凝膠；

- 供經口或經皮投與之乳液及懸浮液；半固體製劑；

- 活性化合物係於油膏基質或水包油或油包水乳液基質中加工之調配物；

- 固體製劑，諸如散劑、預混物或濃縮物、顆粒、丸劑、錠劑、大丸劑、膠囊，氣霧劑及吸入劑，及含有活性化合物之成形物品。

適合於注射之組合物係藉由將活性成份溶解於合適溶劑中且視情況添加諸如酸、鹼、緩衝鹽、防腐劑及增溶劑之其他成份來製備。過濾溶液且無菌填充。

合適之溶劑為生理學上耐受之溶劑，諸如水；烷醇，諸如乙醇、丁醇、苯甲醇、甘油、丙二醇、聚乙二醇；N-甲基-吡咯啶酮；2-吡咯啶酮；及其混合物。

可將活性化合物視情況溶解於生理學上耐受之適合於注射之植物油或合成油中。

合適之增溶劑為促進活性化合物溶解於主溶劑中或防止

其沈澱之溶劑。實例為聚乙烯吡咯啶酮、聚乙烯醇、聚乙氧基化蓖麻油及聚乙氧基化脫水山梨糖醇酯。

合適之防腐劑為苯甲醇、三氯丁醇、對羥基苯甲酸酯及正丁醇。

口服溶液係直接投與。濃縮物係在預先稀釋至使用濃度之後經口投與。口服溶液及濃縮物係根據技術現狀且如上文關於注射溶液所述(無菌程序並非必需)來製備。

用於皮膚上之溶液係點滴、撒布於皮膚上，擦入皮膚中，噴淋或噴灑於皮膚上。

用於皮膚上之溶液係根據技術現狀且根據上文關於注射溶液所述(無菌程序並非必需)來製備。

其他適合之溶劑為聚丙二醇、苯乙醇、苯氧基乙醇；酯，諸如乙酸乙酯或乙酸丁酯、苯甲酸苯甲酯；醚，諸如烷二醇烷基醚，例如二丙二醇單甲醚；酮，諸如丙酮、甲基乙基酮；芳族烴；植物油及合成油；二甲基甲醯胺、二甲基乙醯胺；二乙二醇單乙醚(transcutol)；丙酮縮甘油(solketal)；碳酸丙二酯；及其混合物。

在製備期間添加增稠劑可為有利的。合適之增稠劑為無機增稠劑，諸如膨潤土、膠狀矽酸、單硬脂酸鋁；有機增稠劑，諸如纖維素衍生物、聚乙烯醇及其共聚物、丙烯酸酯及甲基丙烯酸酯。

凝膠係施用或撒布於皮膚上或引入體腔中。藉由用足夠增稠劑處理已如在注射溶液之狀況下所述而製備之溶液使得產生具有油膏樣稠度之透明物質來製備凝膠。所用增稠

劑為上文所給出之增稠劑。

傾倒式調配物係傾倒或噴灑於皮膚之限定區域上，其中活性化合物滲透皮膚且發揮全身作用。

傾倒式調配物係藉由將活性化合物溶解、懸浮或乳化於合適之皮膚相容性溶劑或溶劑混合物中來製備。適當時，添加諸如著色劑、生物吸收促進物質、抗氧化劑、光穩定劑、黏著劑之其他助劑。

合適之溶劑為：水；烷醇、二醇、聚乙二醇、聚丙二醇、甘油；芳醇，諸如苯甲醇、苯乙醇、苯氧基乙醇；酯，諸如乙酸乙酯、乙酸丁酯、苯甲酸苯甲酯；醚，諸如烷二醇烷基醚，諸如二丙二醇單甲醚、二乙二醇單丁醚；酮，諸如丙酮、甲基乙基酮；環狀碳酸酯，諸如碳酸丙二酯、碳酸乙二酯；芳族及/或脂族烴；植物油或合成油；DMF；二甲基乙醯胺；正烷基吡咯啶酮，諸如甲基吡咯啶酮、正丁基吡咯啶酮或正辛基吡咯啶酮；N-甲基吡咯啶酮；2-吡咯啶酮；2,2-二甲基-4-氧基-亞甲基-1,3-二氧戊環及甘油縮甲醛。

合適之著色劑為允許用於動物體表且可溶解或懸浮之所有著色劑。

合適之吸收促進物質為(例如)DMSO，諸如十四烷酸異丙酯、二丙二醇壬酸酯、矽油及其與聚醚之共聚物的撒布油，脂肪酸酯，甘油三酯，脂肪醇。

合適之抗氧化劑為亞硫酸鹽或諸如偏亞硫酸氫鉀之偏亞硫酸氫鹽、抗壞血酸、丁基羥基甲苯、丁基羥基甲氧苯、

生育酚。

合適之光穩定劑為(例如)2-苯基苯并咪唑-5-磺酸(novantisolic acid)。

合適之黏著劑為(例如)纖維素衍生物、澱粉衍生物、聚丙烯酸酯、天然聚合物(諸如海藻酸酯、明膠)。

乳液可經口、經皮或以注射液形式投與。

乳液為油包水乳液或水包油乳液。

其係藉由將活性化合物溶解於疏水相或親水相中且藉助於合適乳化劑及(適當時)諸如著色劑、吸收促進物質、防腐劑、抗氧化劑、光穩定劑、黏度增強物質之其他助劑使其與另一相之溶劑均質化來製備。

合適之疏水相(油)為：

液體石蠟、矽油、天然植物油(諸如芝麻油、杏仁油、蓖麻油)、合成甘油三酯(諸如辛酸/癸酸甘油二酯)、具有鏈長為C_8-C_{12}之植物脂肪酸或其他特定選擇之天然脂肪酸的甘油三酯混合物、可能亦含有羥基之飽和或不飽和脂肪酸之偏甘油酯混合物、C_8-C_{10}脂肪酸之甘油單酯及甘油二酯；

諸如硬脂酸乙酯、己二酸二正丁醯酯、月桂酸己酯、二丙二醇壬酸酯之脂肪酸酯，中等鏈長之分支鏈脂肪酸與鏈長為C_{16}-C_{18}之飽和脂肪醇的酯，十四烷酸異丙酯，棕櫚酸異丙酯，鏈長為C_{12}-C_{18}之飽和脂肪醇之辛酸/癸酸酯，硬脂酸異丙酯，油醇油酸酯，油酸癸酯，油酸乙酯，乳酸乙酯，諸如合成鴨尾脂腺脂(synthetic duck coccygeal gland fat)

之蠟狀脂肪酸酯，鄰苯二甲酸二丁酯、己二酸二異丙酯及與後者相關之酯混合物，諸如異十三烷醇、2-辛基十二烷醇、十六醇十八醇、油醇之脂肪醇，及諸如油酸之脂肪酸及其混合物。

合適之親水相為：水；醇，諸如丙二醇、甘油、山梨糖醇；及其混合物。

合適之乳化劑為：

非離子型界面活性劑，例如聚乙氧基化蓖麻油、聚乙氧基化脫水山梨糖醇單油酸酯、脫水山梨糖醇單硬脂酸酯、單硬脂酸甘油酯、聚氧乙基硬脂酸酯、烷基酚聚乙二醇醚；

兩性界面活性劑，諸如N-月桂基-對亞胺基二丙酸二鈉或卵磷脂；

陰離子型界面活性劑，諸如月桂基硫酸鈉、脂肪醇醚硫酸鹽、單/二烷基聚乙二醇醚正磷酸酯單乙醇胺鹽；

陽離子型活性界面活性劑，諸如氯化十六基三甲基銨。

其他合適之助劑為：增強黏度且使乳液穩定之物質，諸如羧甲基纖維素、甲基纖維素及其他纖維素及澱粉衍生物，聚丙烯酸酯、海藻酸酯、明膠、阿拉伯膠、聚乙烯吡咯啶酮、聚乙烯醇、甲基乙烯基醚與順丁烯二酸酐之共聚物、聚乙二醇、蠟、膠狀矽酸或所提及之物質的混合物。

懸浮液可經口或局部/經皮投與。其係藉由使活性化合物懸浮於懸浮劑中且(適當時)添加諸如濕潤劑、著色劑、生物吸收促進物質、防腐劑、抗氧化劑、光穩定劑之其他

助劑來製備。

液體懸浮劑為所有均質溶劑及溶劑混合物。

合適之濕潤劑(分散劑)為上文所給出之乳化劑。

可提及之其他助劑為上文所給出之彼等助劑。

半固體製劑可經口或局部/經皮投與。其與上文所述之懸浮液及乳液的不同之處僅在於其黏度較高。

為製備固體製劑，將活性化合物與合適之賦形劑混合，適當時添加助劑，且將其製成所要形式。

合適之賦形劑為所有生理學上耐受之固體惰性物質。所用賦形劑為無機及有機物質。無機物質為(例如)氯化鈉、諸如碳酸鈣之碳酸鹽、碳酸氫鹽、氧化鋁、氧化鈦、矽酸、黏土、沈澱二氧化矽或膠狀二氧化矽或磷酸鹽。有機物質為(例如)糖，纖維素，諸如奶粉、動物粗粉、穀粒粗粉及穀屑之食物及飼料，澱粉。

合適之助劑為上文已提及之防腐劑、抗氧化劑及/或著色劑。

其他合適之助劑為潤滑劑及助流劑，諸如硬脂酸鎂、硬脂酸、滑石、膨潤土；崩解促進物質，諸如澱粉或交聯聚乙烯吡咯啶酮；黏合劑，諸如澱粉、明膠或線性聚乙烯吡咯啶酮；及乾黏合劑，諸如微晶纖維素。

一般而言，「殺寄生蟲有效量」意謂達成對生長可觀測之作用所需的活性成份之量，該等作用包括壞死、死亡、延遲、預防及移除、破壞或以其他方式減少目標有機體出現及活性的作用。對於本發明所用之各種化合物/組合物

而言，殺寄生蟲有效量可不同。組合物之殺寄生蟲有效量亦將根據主要條件而變，該等條件為諸如所要殺寄生蟲作用及持續時間、目標物種、施用模式及其類似條件。

可在本發明中使用之組合物一般可包含約0.001%至95%之式I化合物。

一般而言，施用總量為每天每公斤0.5毫克至100毫克之式I化合物為有利的，較佳為每天每公斤1毫克至50毫克。

即用製劑含有對寄生蟲(較佳外寄生蟲)起作用之化合物，其濃度為10 ppm至80重量%，較佳為0.1重量%至65重量%，更佳為1重量%至50重量%，最佳為5重量%至40重量%。

在使用前稀釋之製劑含有對外寄生蟲起作用之化合物，其濃度為0.5重量%至90重量%，較佳為1重量%至50重量%。

此外，製劑包含對抗內寄生蟲之式I化合物，其濃度為10 ppm至2重量%，較佳為0.05重量%至0.9重量%，極其較佳為0.005重量%至0.25重量%。

在本發明之一較佳實施例中，包含式I化合物之組合物係經皮/局部施用。

在另一較佳實施例中，局部施用係以含有化合物之成形物品的形式進行，該等物品為諸如項圈、徽章、耳標、用於在身體部分固定之條帶及黏著帶及箔片。

一般而言，施用在三週期間釋放總量為每公斤處理動物體重10毫克至300毫克、較佳20毫克至200毫克、最佳25毫

克至160毫克之式I化合物的固體調配物為有利的。

為製備成形物品，使用熱塑性及可撓性塑膠以及彈性體及熱塑性彈性體。合適之塑膠及彈性體為與式I化合物充分相容之聚乙烯樹脂、聚胺基甲酸酯、聚丙烯酸酯、環氧樹脂、纖維素、纖維素衍生物、聚醯胺及聚酯。塑膠及彈性體之詳細清單以及成形物品之製備程序在(例如)WO 03/086075中給出。

【實施方式】

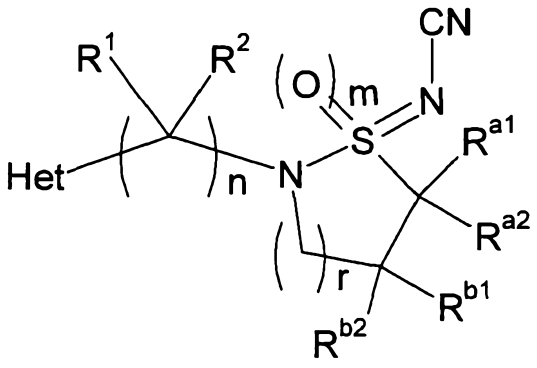
現由以下實例進一步詳細地說明本發明。

實例：

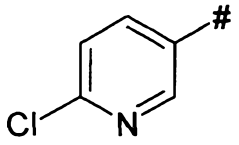
現由以下實例進一步詳細地說明本發明。

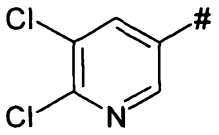
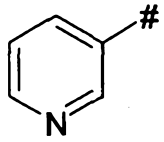
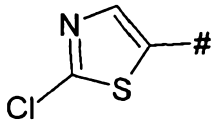
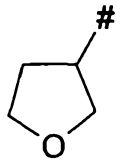
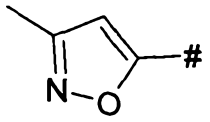
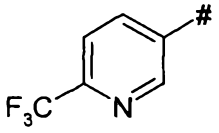
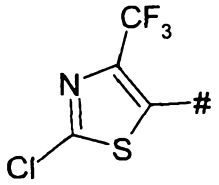
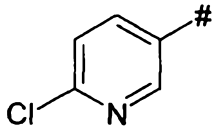
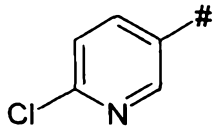
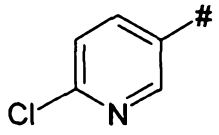
本發明之式I化合物之實例在以下表E.1、表E.2及表E.3中給出。

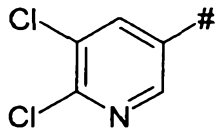
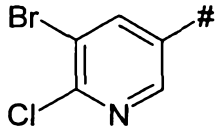
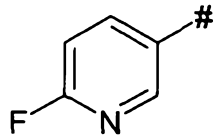
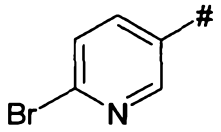
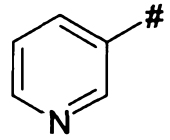
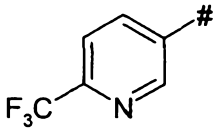
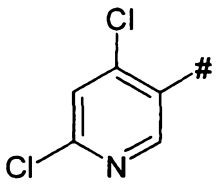
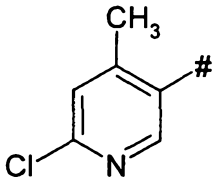
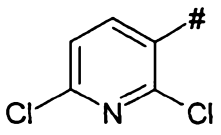
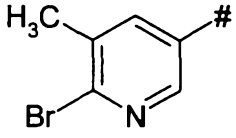
表E.1：式I-E化合物之實例：

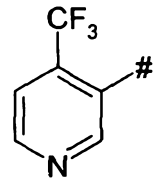
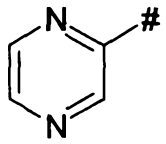
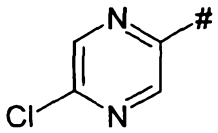
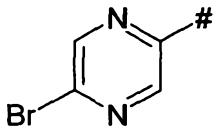
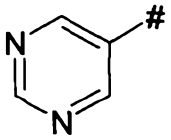
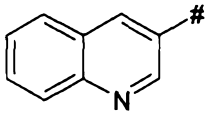
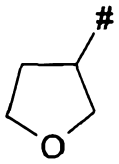
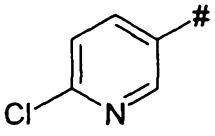
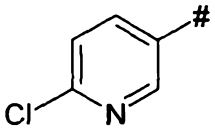
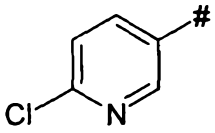


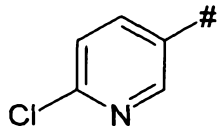
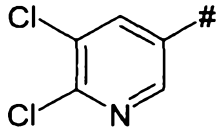
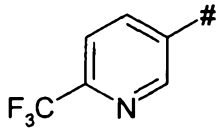
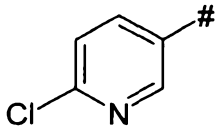
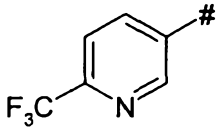
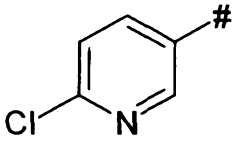
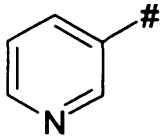
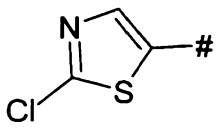
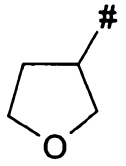
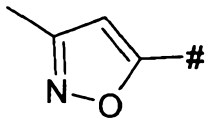
式(I-E)

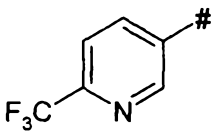
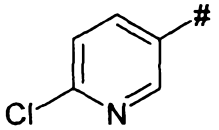
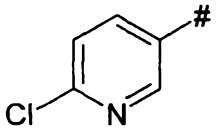
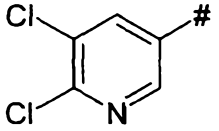
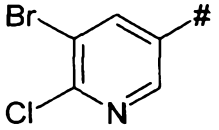
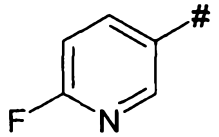
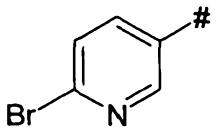
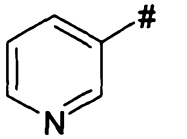
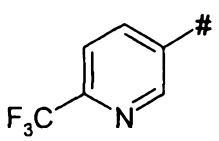
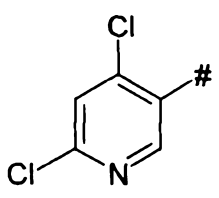
編號	Het	n	m	R^1	R^2	r	R^{a1}	R^{a2}	R^{b1}	R^{b2}
1		1	1	H	H	1	H	H	H	H

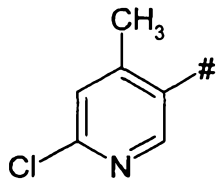
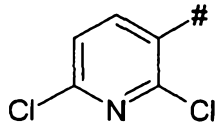
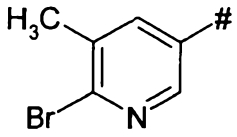
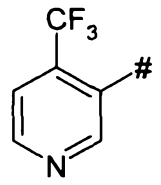
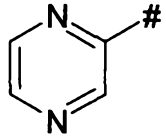
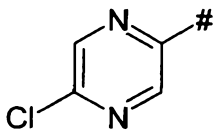
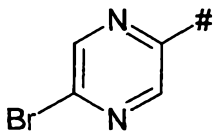
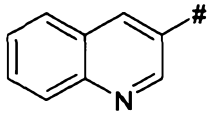
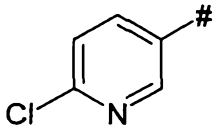
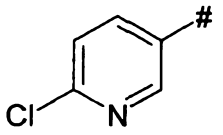
編號	Het	n	m	R^1	R^2	r	R^{a1}	R^{a2}	R^{b1}	R^{b2}
2		1	1	H	H	1	H	H	H	H
3		1	1	H	H	1	H	H	H	H
4		1	1	H	H	1	H	H	H	H
5		1	1	H	H	1	H	H	H	H
6		1	1	H	H	1	H	H	H	H
7		1	1	H	H	1	H	H	H	H
8		1	1	H	H	1	H	H	H	H
9		1	1	CH_3	H	1	H	H	H	H
10		1	1	H	H	2	H	H	H	H
11		0	1	-	-	1	H	H	H	H

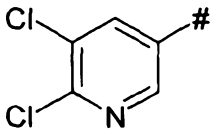
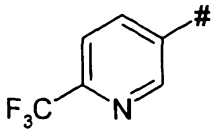
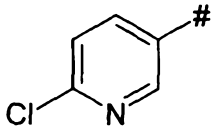
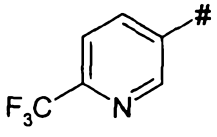
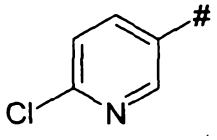
編號	Het	n	m	R^1	R^2	r	R^{a1}	R^{a2}	R^{b1}	R^{b2}
12		0	1	-	-	1	H	H	H	H
13		0	1	-	-	1	H	H	H	H
14		0	1	-	-	1	H	H	H	H
15		0	1	-	-	1	H	H	H	H
16		0	1	-	-	1	H	H	H	H
17		0	1	-	-	1	H	H	H	H
18		0	1	-	-	1	H	H	H	H
19		0	1	-	-	1	H	H	H	H
20		0	1	-	-	1	H	H	H	H
21		0	1	-	-	1	H	H	H	H

編號	Het	n	m	R^1	R^2	r	R^{a1}	R^{a2}	R^{b1}	R^{b2}
22		0	1	-	-	1	H	H	H	H
23		0	1	-	-	1	H	H	H	H
24		0	1	-	-	1	H	H	H	H
25		0	1	-	-	1	H	H	H	H
26		0	1	-	-	1	H	H	H	H
27		0	1	-	-	1	H	H	H	H
28		0	1	-	-	1	H	H	H	H
29		0	1	-	-	2	H	H	H	H
30		0	1	-	-	1	CH_3	H	H	H
31		0	1	-	-	1	Br	H	H	H

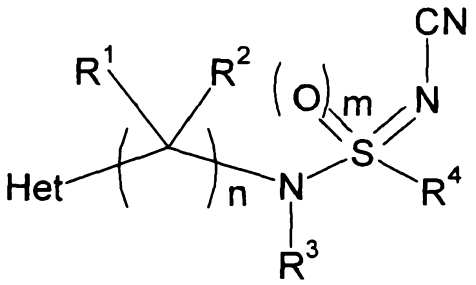
編號	Het	n	m	R^1	R^2	r	R^{a1}	R^{a2}	R^{b1}	R^{b2}
32		0	1	-	-	1	H	H	CH_3	H
33		0	1	-	-	1	H	H	CH_3	H
34		0	1	-	-	1	H	H	CH_3	H
35		0	1	-	-	1	H	H	CH_3	CH_3
36		0	1	-	-	1	H	H	CH_3	CH_3
37		1	0	H	H	1	H	H	H	H
38		1	0	H	H	1	H	H	H	H
39		1	0	H	H	1	H	H	H	H
40		1	0	H	H	1	H	H	H	H
41		1	0	H	H	1	H	H	H	H

編號	Het	n	m	R^1	R^2	r	R^{a1}	R^{a2}	R^{b1}	R^{b2}
42		1	0	H	H	1	H	H	H	H
43		1	0	H	H	2	H	H	H	H
44		0	0	-	-	1	H	H	H	H
45		0	0	-	-	1	H	H	H	H
46		0	0	-	-	1	H	H	H	H
47		0	0	-	-	1	H	H	H	H
48		0	0	-	-	1	H	H	H	H
49		0	0	-	-	1	H	H	H	H
50		0	0	-	-	1	H	H	H	H
51		0	0	-	-	1	H	H	H	H

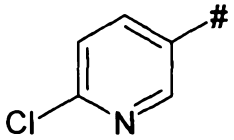
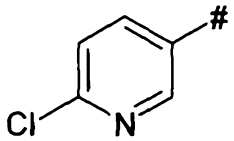
編號	Het	n	m	R^1	R^2	r	R^{a1}	R^{a2}	R^{b1}	R^{b2}
52		0	0	-	-	1	H	H	H	H
53		0	0	-	-	1	H	H	H	H
54		0	0	-	-	1	H	H	H	H
55		0	0	-	-	1	H	H	H	H
56		0	0	-	-	1	H	H	H	H
57		0	0	-	-	1	H	H	H	H
58		0	0	-	-	1	H	H	H	H
59		0	0	-	-	1	H	H	H	H
60		0	0	-	-	2	H	H	H	H
61		0	0	-	-	1	H	H	CH_3	H

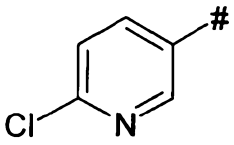
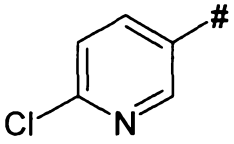
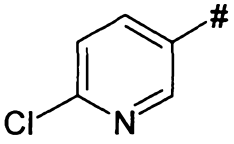
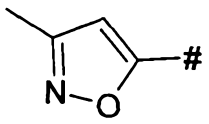
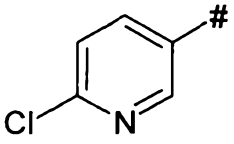
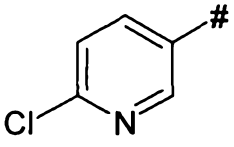
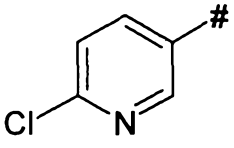
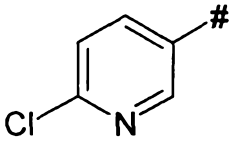
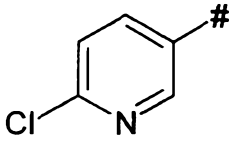
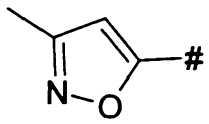
編號	Het	n	m	R^1	R^2	r	R^{a1}	R^{a2}	R^{b1}	R^{b2}
62		0	0	-	-	1	H	H	CH_3	H
63		0	0	-	-	1	H	H	CH_3	H
64		0	0	-	-	1	H	H	CH_3	CH_3
65		0	0	-	-	1	H	H	CH_3	CH_3
66		0	0	-	-	1	H	H		H

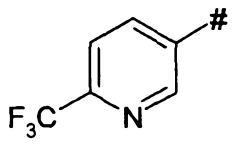
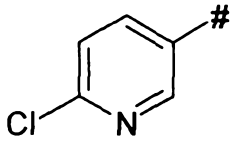
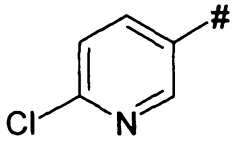
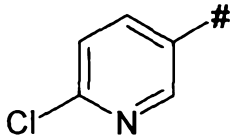
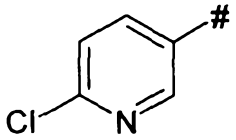
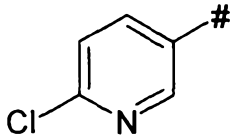
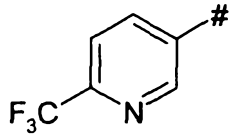
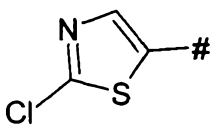
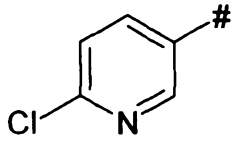
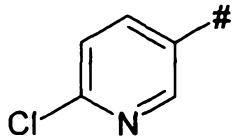
表E.2：式I-F化合物之實例：

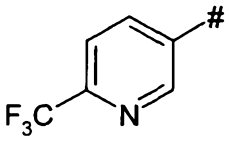
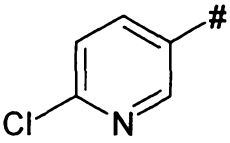
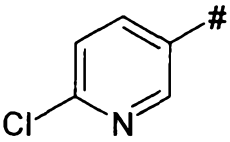
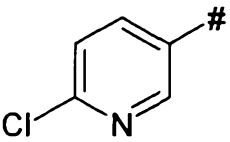
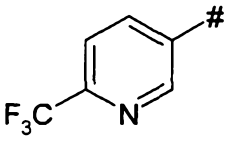
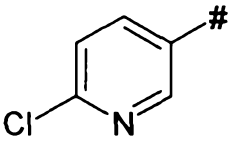
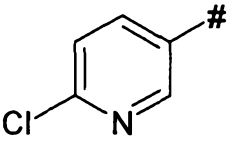
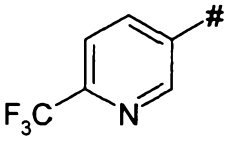


式(I-F)

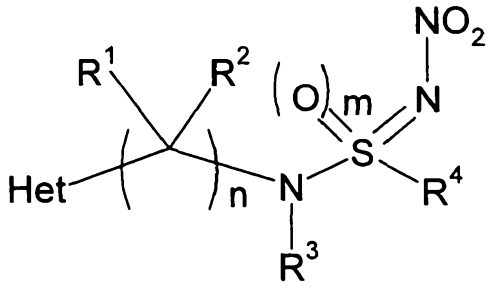
編號	Het	n	m	R^1	R^2	R^3	R^4
67		1	1	CH_3	H	CH_3	CH_3
68		1	1	CH_3	H		CH_3

編號	Het	n	m	R^1	R^2	R^3	R^4
69		1	1		H	CH_3	CH_3
70		1	1	CH_3	H		CH_3
71		1	1		H	CH_3	CH_3
72		1	1	H	H	CH_3	CH_3
73		1	0	CH_3	H	CH_3	CH_3
74		1	0	CH_3	H		CH_3
75		1	0		H	CH_3	CH_3
76		1	0	CH_3	H		CH_3
77		1	0		H	CH_3	CH_3
78		1	0	H	H	CH_3	CH_3

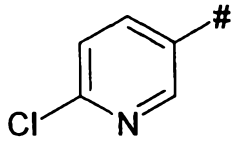
編號	Het	n	m	R^1	R^2	R^3	R^4
79		1	1	H	H	C_2H_5	CH_3
80		1	1	H	H		CH_3
81		0	1	-	-	H	CH_3
82		1	1	H	H	CH_3	
83		1	1	H	H		CH_3
84		1	1	H	H	CH_3	C_2H_5
85		1	1	H	H	CH_3	CH_3
86		1	1	H	H	CH_3	CH_3
87		1	1	H	H		C_2H_5
88		1	1	H	H	C_2H_5	

編號	Het	n	m	R^1	R^2	R^3	R^4
89		1	1	H	H		CH_3
90		1	1	H	H	H	CH_3
91		1	1	H	H	CH_3	CH_3
92		1	1	H	H	C_2H_5	CH_3
93		1	1	H	H		CH_3
94		1	1	H	H	C_2H_5	C_2H_5
95		1	1	H	H		C_2H_5
96		0	1	-	-	H	CH_3

表E.3：式I-G化合物之實例：



式(I-G)

編號	Het	n	m	R^1	R^2	R^3	R^4
97		1	1	H	H	CH_3	CH_3

化合物實例可(例如)藉由偶合高效液相層析/質譜分析(HPLC/MS)、藉由^{1}H-NMR及/或藉由其熔點來表徵。

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

^{1}H-NMR：信號之特徵在於相對於四甲基矽烷之化學位移(ppm)、其多重性及其積分(所給出之相對氫原子數)。以下縮寫用於表徵信號之多重性：m=多重峰，q=四重峰，t=三重峰，d=雙重峰且s=單峰。

表E：上述表E.1、表E.2及表E.3中所給出之化合物實例的物理化學資料

化合物編號	物理化學資料 熔點[℃]， 滯留時間t_r [min]，m/z (HPLC/MS)或 ^{1}H-NMR ($CDCl_3$) [δ ppm]
1	t_r = 1.77 min m/z = 271
2	t_r = 2.46 min m/z = 305
3	t_r = 0.74 min m/z = 237
4	^{1}H-NMR: 7.58 (s), 4.58 (s), 3.63-3.77 (m), 3.47 (mc), 2.52 (mc)
5	t_r = 1.37 min m/z = 230
6	^{1}H-NMR: 6.27 (s), 4.52 (d), 4.44 (d), 3.70 (mc), 3.57 (mc), 2.56 (mc), 2.31 (s)
7	^{1}H-NMR: 8.74 (s), 8.02 (d), 7.60 (d), 4.51 (d), 4.48 (d), 3.76 (mc), 3.61 (mc), 3.41 (mc), 2.55 (mc)
8	t_r = 2.50 min m/z = 345
9	t_r = 2.12 min m/z = 285
10	^{1}H-NMR: 8.35 (d), 7.79 (dd), 7.39 (d), 4.46 (d), 4.37 (d), 3.67 (mc), 3.60 (mc), 3.20 (mc), 2.34 (mc), 1.78 (mc)
11	t_r = 1.84 min m/z = 257
12	t_r = 2.45 min m/z = 293
13	t_r = 2.50 min m/z = 336
14	t_r = 1.67 min m/z = 241
15	熔點= 147℃ t_r = 1.89 min m/z = 301
16	熔點 = 96℃ t_r = 0.85 min m/z = 223
17	t_r = 2.32 min m/z = 291
18	t_r = 2.24 min m/z = 292
19	t_r = 2.08 min m/z = 271
20	t_r = 2.11 min m/z = 292
21	t_r = 2.13 min m/z = 315
22	t_r = 1.81 min m/z = 291

化合物 編號	物理化學資料 熔點[℃]， 滯留時間t_r [min]，m/z (HPLC/MS)或 ^{1}H-NMR ($CDCl_3$) [δ ppm]
23	t_r = 1.27 min m/z = 224
24	t_r = 2.24 min m/z = 258
25	t_r = 1.79 min m/z = 303
26	^{1}H-NMR: 9.18 (s), 8.82 (s), 4.12 (mc), 3.92-4.03 (m), 3.75 (mc), 2.80 (mc)
27	t_r = 1.93 min m/z = 273
28	t_r = 1.06 min m/z = 216
29	熔點 = 135℃ t_r = 2.03 min m/z = 271
30	t_r = 2.10 min m/z = 271
31	t_r = 2.26 min m/z = 336
32	熔點= 125℃ t_r = 2.18 min m/z = 271
33	t_r = 2.52 min m/z = 306
34	t_r = 2.45 min m/z = 305
35	熔點 = 90℃ t_r = 2.40 min m/z = 285
36	t_r = 2.75 min m/z = 319
37	t_r = 1.57 min m/z = 255
38	t_r = 0.57 min m/z = 221
39	t_r = 1.74 min m/z = 261
40	t_r = 1.24 min m/z = 214
41	^{1}H-NMR: 6.31 (s), 4.57 (d), 4.40 (d), 3.68 (mc), 3.44 (mc), 2.36 (mc), 2.33 (s)
42	t_r = 1.98 min m/z = 289
43	^{1}H-NMR: 8.36 (d), 7.68 (dd), 7.38 (d), 4.33 (d), 3.97 (d), 3.52 (mc), 3.13 (mc), 2.99 (mc), 2.72 (mc), 2.58 (mc), 1.89 (mc), 1.73 (mc)

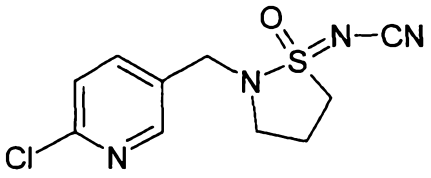
化合物編號	物理化學資料 熔點[℃]， 滯留時間t_r [min]，m/z (HPLC/MS)或 ^{1}H-NMR ($CDCl_3$) [δ ppm]
44	t_r = 1.64 min m/z = 241
45	t_r = 2.17 min m/z = 275
46	t_r = 2.26 min m/z = 321
47	t_r = 1.42 min m/z = 225
48	熔點= 163℃ t_r = 1.71 min m/z = 285
49	t_r = 0.67 min m/z = 207
50	t_r = 1.97 min m/z = 275
51	t_r = 2.01 min m/z = 275
52	t_r = 1.85 min m/z = 255
53	t_r = 1.97 min m/z = 276
54	t_r = 2.08 min m/z = 301
55	t_r = 1.85 min m/z = 275
56	t_r = 1.09 min m/z = 208
57	t_r = 1.56 min m/z = 242
58	t_r = 1.69 min m/z = 286
59	t_r = 1.60 min m/z = 257
60	熔點= 155℃ t_r = 1.80 min m/z = 255
61	t_r = 1.98 min m/z = 255
62	t_r = 2.27 min m/z = 289
63	t_r = 2.35 min m/z = 289
64	t_r = 2.09 min m/z = 269
65	t_r = 2.53 min m/z = 303

化合物 編號	物理化學資料 熔點[℃]， 滯留時間t_r [min]，m/z (HPLC/MS)或 ^{1}H-NMR ($CDCl_3$) [δ ppm]
66	t_r = 2.59; 2.86 min m/z = 333
67	t_r = 2.03 min m/z = 273
68	t_r = 2.41 min m/z = 299
69	t_r = 2.58; 2.64 min m/z = 301
70	t_r = 2.26; 2.33 min m/z = 301
71	t_r = 2.34 min m/z = 299
72	t_r = 1.55 min m/z = 229
73	t_r = 1.78 min m/z = 257
74	t_r = 2.02 min m/z = 283
75	t_r = 2.17 min m/z = 285
76	t_r = 2.08; 2.17 min m/z = 285
77	t_r = 2.14 min m/z = 283
78	t_r = 1.34 min m/z = 213
79	t_r = 2.46 min m/z = 307
80	t_r =2.23 min m/z = 285
81	t_r = 1.72 min m/z = 231
82	t_r = 2.30 min m/z = 285
83	t_r = 2.22 min m/z = 299
84	t_r = 2.10 min m/z = 272
85	t_r = 2.42 min m/z = 293
86	t_r = 2.06 min m/z = 265
87	t_r = 2.64 min m/z = 312
88	t_r = 2.42 min m/z = 299

化合物編號	物理化學資料 熔點[℃]， 滯留時間t_r [min]，m/z (HPLC/MS)或 ^{1}H-NMR ($CDCl_3$) [δ ppm]
89	t_r = 2.54 min m/z = 319
90	t_r = 1.70 min m/z = 245
91	t_r = 2.00 min m/z = 259
92	t_r = 2.20 min m/z = 273
93	t_r = 2.76 min m/z = 333
94	t_r = 2.34 min m/z = 286
95	t_r = 2.22 min m/z = 299
96	t_r = 2.04 min m/z = 265
97	t_r = 2.26 min m/z = 279

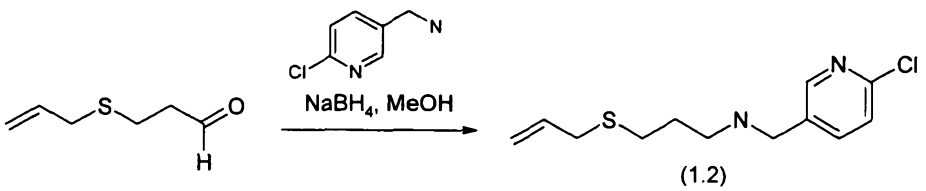
合成實例

合成實例S.1：



第1號化合物

步驟1.1:



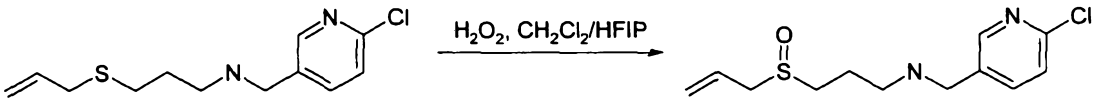
(1.2)

在0℃下將3-烯丙基硫基-丙醛(1.5 g，11.8 mmol)於MeOH(15 mL)中之溶液添加至C-(6-氯-吡啶-3-基)-甲基胺

(1.8 g，12.6 mmol)於MeOH(15 mL)中之溶液中。將所得溶液在此溫度下攪拌1 h，接著逐份添加硼氫化鈉(960 mg，25.3 mmol)且在室溫下繼續攪拌16 h。在減壓下移除揮發物且將殘餘物再溶解於CH_2Cl_2中且用飽和$NaHCO_3$水溶液洗滌。將有機相經$MgSO_4$乾燥且蒸發。對殘餘物進行急驟管柱層析純化(經NH_2改性之SiO_2，環己烷/EtOAc之梯度)得到950 mg(31%)烯丙基硫醚(1.2)。

^{1}H-NMR: δ 8.31 (d, *J*=2.7 Hz, 1 H), 7.66 (dd, *J*=8.2, 2.7 Hz, 1 H), 7.28 (d, *J*=8.2 Hz, 1 H), 5.76 (m, 1 H), 5.08 (m, 2 H), 3.77 (s, 2 H), 3.11 (d, *J*=7.1 Hz, 2 H), 2.70 (t, *J*=7.1 Hz, 2 H), 2.51 (t, *J*=7.1 Hz, 2 H), 1.75 (q, *J*=7.1 Hz, 2 H) ppm。

步驟1.2：



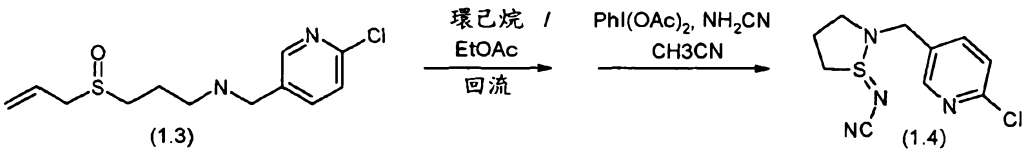
(1.2) (1.3)

在0℃下將過氧化氫(1.51 mL 30%水溶液，14.8 mmol)添加至烯丙基硫醚(1.2)(950 mg，3.7 mmol)於CH_2Cl_2/六氟異丙醇(1:2，12 mL)中之溶液中，且將溶液在室溫下攪拌4 h。冷卻至0℃後，添加Na_2SO_3及$NaHCO_3$之飽和水溶液。用CH_2Cl_2將水相萃取兩次且將經合併之有機相經$MgSO_4$乾燥且蒸發。

藉由急驟管柱層析(經NH_2改性之SiO_2，環己烷/EtOAc之梯度)純化殘餘物以得到950 mg(94%)烯丙基亞碸(1.3)。

^{1}H-NMR δ 8.30 (d, *J*=2.5 Hz, 2 H), 7.63 (dd, *J*=8.2 ,2.5 Hz, 2 H), 8.27 (d, *J*=8.2 Hz, 2 H), 5.85 (m, 1 H), 5.39 (m, 2 H), 3.77 (s, 2 H), 3.45 (m, 2 H), 2.75 (m, 2 H), 2.51 (t, *J*=7.1 Hz, 2 H), 1.95 (q, *J*=6.6 Hz, 2 H) ppm。

步驟1.3：

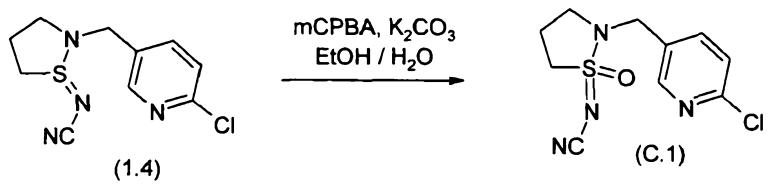


使烯丙基亞碸(1.3)(500 mg，1.83 mmol)於環己烷/EtOAc(25 mL，1:4)中之溶液回流24 h。在減壓下移除揮發物，且將殘餘物再溶解於CH_3CN(10 mL)中且冷卻至0℃。在此溫度下，添加氰胺(42 mg，5.5 mmol)及二乙醯氧基亞碘醯苯(322 mg，2.0 mmol)且在0℃下繼續攪拌5分鐘且在室溫下再攪拌1小時。接著將溶液用EtOAc稀釋且用H_2O洗滌。將有機相經$MgSO_4$乾燥且在減壓下蒸發。

藉由急驟管柱層析(經NH_2改性之SiO_2，環己烷/EtOAc之梯度)純化殘餘物以得到86 mg(18%)亞磺醯亞胺基胺(1.4)。

LC-MS: $C_{10}H_{12}ClN_4S$之質量計算值：$[M+H]^+$ 254.7，實驗值：254.8。t_R=1.57 min。

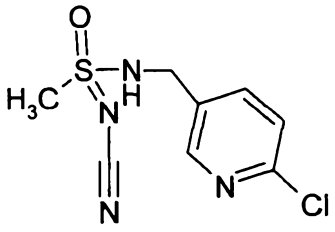
步驟1.4：



將間氯過苯甲酸(170 mg，0.75 mmol)及K_2CO_3(175 mg，1.26 mmol)添加至亞磺醯亞胺基胺(1.4)(64 mg，0.25 mmol)於$EtOH/H_2O$(24:1，5 mL)中之溶液中。將溶液在室溫下攪拌16 h，接著用CH_2Cl_2稀釋且用飽和$NaHCO_3$水溶液洗滌，經$MgSO_4$乾燥且在減壓下蒸發。

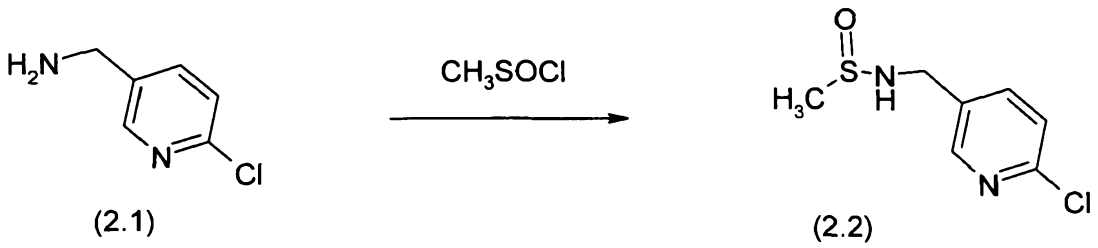
藉由急驟管柱層析(經NH_2改性之SiO_2，環己烷/EtOAc之梯度)純化殘餘物以得到47 mg(54%)磺醯亞胺基胺(C.1)。LC-MS: $C_{10}H_{12}ClN_4OS$之質量計算值：$[M+H]^+$ 270.7，實驗值：270.8。t_R=1.77 min。

合成實例S.2：



第90號化合物

步驟2.1：甲烷亞磺酸(6-氯-吡啶-3-基甲基)-醯胺(2.2)



(2.1)　　(2.2)

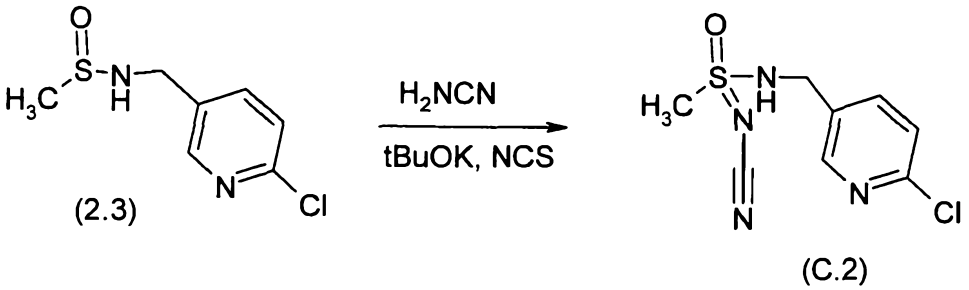
如文獻中所述獲得甲烷亞磺醯氯。將C-(6-氯-吡啶-3-基)-甲基胺(2.1)(25 g，178 mmol)於四氫呋喃(200 ml)中之溶液冷卻至0℃且逐滴添加甲烷亞磺醯氯(7 g，71 mmol)。將溶液溫至室溫且攪拌16小時。藉由過濾移除沈澱物，將

濾液用EtOAc稀釋且用H_2O洗滌。將有機相經Na_2SO_4乾燥且在減壓下蒸發。

藉由急驟管柱層析(環己烷/EtOAc之梯度)純化殘餘物以得到7.20 g甲烷亞磺酸(6-氯-吡啶-3-基甲基)-醯胺(2.2)。

LC-MS $[M+H]^+$ 205.1。t_R=1.46 min。

步驟2.1：N'-氰基，N-(6-氯-吡啶-3-基甲基)甲烷磺醯亞胺醯胺(C.2)

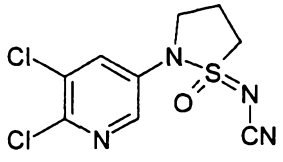


將氰胺(88 mg，2.1 mmol)及第三丁醇鉀(225 mg，2 mmol)添加至甲烷亞磺酸(6-氯-吡啶-3-基甲基)-醯胺(2.3)(200 mg，1 mmol)於無水乙腈中之溶液中。在室溫下添加N-氯代丁二醯亞胺(160 mg，1.2 mmol)且將溶液攪拌3小時。

蒸發溶劑且藉由急驟管柱層析(梯度EtOAc/MeOH)純化殘餘物以得到10 mg N'-氰基，N-(6-氯-吡啶-3-基甲基)甲烷磺醯亞胺醯胺(C.2)。

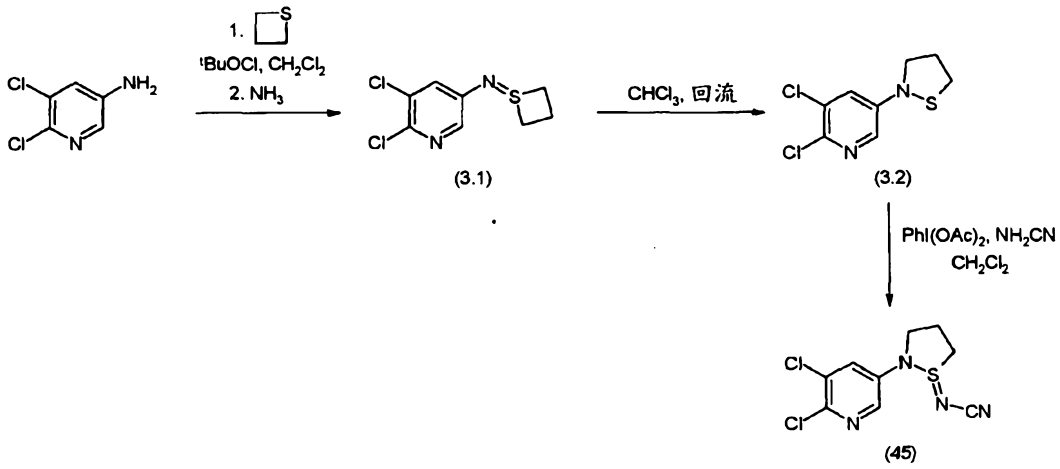
LC-MS $[M+H]^+$ 244.8，t_R=1.58 min。

合成實例S.3：



第12號化合物

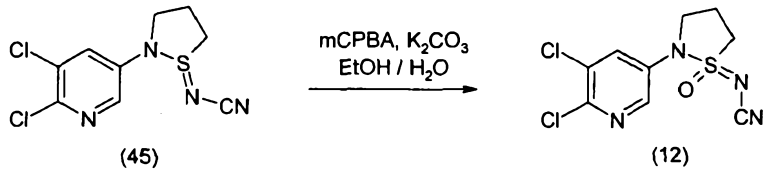
步驟3.1



在-78℃下將^{t}BuOCl(0.65 g，6.01 mmol)於CH_2Cl_2(20 mL)中之溶液逐滴添加至3-胺基-5,6-二氯吡啶(1 g，6.01 mmol)及硫雜環丁烷(0.46 g，6.01 mmol)於CH_2Cl_2(35 mL)中之溶液中。將所得綠色懸浮液在-78℃下攪拌1 h，接著使過量NH_3冷凝至混合物中。接著將懸浮液緩慢溫至周圍溫度且濃縮至約20 mL之體積。藉由過濾移除沈澱物，且在減壓下濃縮濾液以得到1.9 g粗亞磺醯亞胺(3.1)。將粗產物溶解於$CHCl_3$中且使溶液回流3 h。蒸發溶劑後，將粗次磺醯胺(3.2)再溶解於CH_2Cl_2(60 mL)中且冷卻至0℃。在此溫度下，添加氰胺(0.32 g，7.5 mmol)及二乙醯氧基亞碘醯苯(2.4 g，7.5 mmol)且將溶液在0℃下攪拌1 h，接著在1 h內溫至周圍溫度。添加H_2O且將水相用CH_2Cl_2萃取兩次。將經合併之有機相用飽和NaCl水溶液洗滌，經$MgSO_4$乾燥且在減壓下蒸發。藉由急驟管柱層析(經NH_2改性之SiO_2，環己烷/EtOAc之梯度)純化殘餘物以得到0.5 g(總共30%)亞磺醯亞胺基胺(45)。

LC-MS: $C_9H_{10}Cl_2N_4S$之質量計算值：$[M+H]^+$ 276，實驗值：276；t_R=2.17 min。

步驟3.2

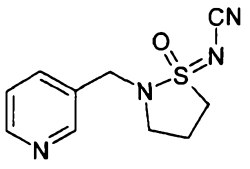


(45) (12)

將K_2CO_3(1.15 g，8.3 mmol)之水溶液添加至亞磺醯亞胺基胺(45)(380 mg，1.38 mmol)於EtOH(6 mL)中之溶液中，接著逐滴添加間氯過苯甲酸(360 mg，2.1 mmol)於EtOH(2 mL)中之溶液。將溶液溫至周圍溫度且逐滴添加間氯過苯甲酸(360 mg，2.1 mmol)於EtOH(2 mL)中之溶液。將溶液在室溫下攪拌30 min，接著用CH_2Cl_2稀釋且用10% $NaHCO_3$水溶液洗滌，經$MgSO_4$乾燥且在減壓下蒸發。藉由急驟管柱層析(經NH_2改性之SiO_2，環己烷/EtOAc之梯度)純化殘餘物以得到360 mg(90%)磺醯亞胺基胺(12)。

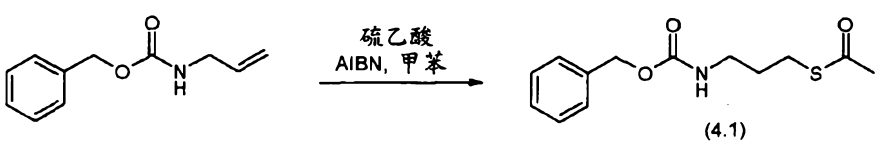
LC-MS: $C_9H_{10}Cl_2N_4OS$之質量計算值：$[M+H]^+$ 292，實驗值：292；t_R=2.45 min。

合成實例4：



第3號化合物

步驟4.1

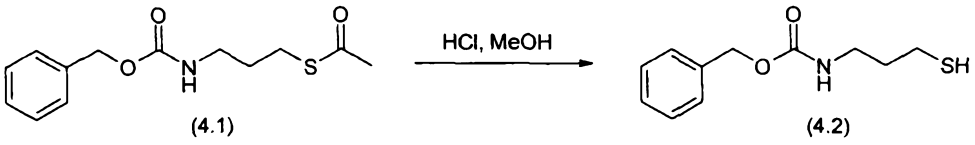


(4.1)

使N-烯丙基胺基甲酸苯甲酯(138.9 g，0.69 mol)、硫乙酸(157.4 g，2.07 mol)及AIBN(催化量)於甲苯(700 mL)中之溶液回流3 h。將溶液用EtOAc稀釋且藉由緩慢添加10% Na_2CO_3水溶液而中和。將有機相用飽和NaCl水溶液洗滌，經$MgSO_4$乾燥且在減壓下蒸發以得到181.6 g(98%)硫乙酸酯(4.1)。

LC-MS: $C_{13}H_{18}NO_3S$之質量計算值：$[M+H]^+$ 268，實驗值：268；t_R=2.80 min。

步驟4.2

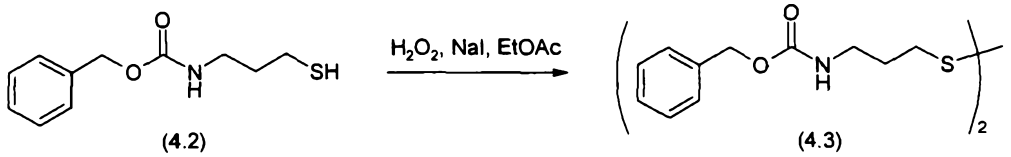


(4.1) (4.2)

將濃鹽酸(65 mL)添加至硫乙酸酯(4.1)(181.5 g，0.68 mol)於MeOH(1 L)中之溶液中，且使溶液回流16 h。在減壓下移除溶劑且將殘餘物再溶解於甲基第三丁基醚中。藉由緩慢添加10% $NaHCO_3$水溶液來中和溶液。將有機相經$MgSO_4$乾燥且在減壓下蒸發以得到124.2 g(81%)硫醇(4.2)。

LC-MS: $C_{11}H_{16}NO_2S$之質量計算值：$[M+H]^+$ 226，實驗值：226；t_R=2.89 min。

步驟4.3

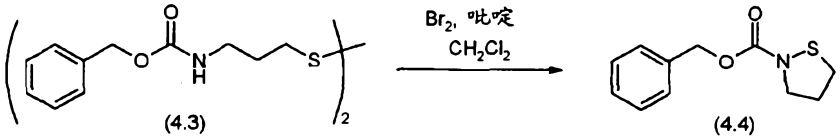


(4.2) (4.3)

在0℃下將H_2O_2(於H_2O中之30%，62.4 g，0.55 mol)之溶液逐滴添加至硫醇(4.2)(124 g，0.55 mol)及NaI(0.83 g，5.5 mmol)於EtOAc(1 L)中之溶液中。將溶液溫至周圍溫度且攪拌1 h。添加飽和$Na_2S_2O_3$水溶液(300 mL)且用EtOAc將水相萃取兩次。將經合併之有機相用飽和NaCl水溶液洗滌，經$MgSO_4$乾燥且在減壓下蒸發。使殘餘物自EtOAc中再結晶以得到92.4 g(75%)二硫醚(4.3)。

LC-MS: $C_{22}H_{29}N_2O_4S_2$之質量計算值：$[M+H]^+$ 449，實驗值：449；t_R=3.54 min。

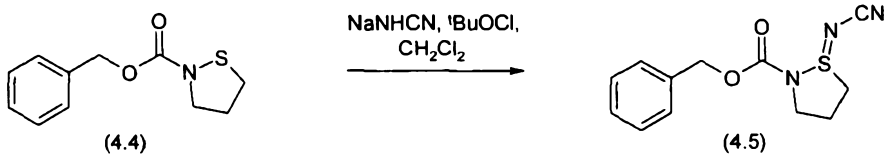
步驟4.4



在-78℃下於4 h內將Br_2(9.35 g，58.5 mmol)於CH_2Cl_2(100 mL)中之溶液逐滴添加至二硫醚(4.3)(25 g，55.7 mmol)及吡啶(67 g，0.85 mol)於CH_2Cl_2(700 mL)中之溶液中。將溶液溫至0℃且在此溫度下攪拌1 h。添加飽和$Na_2S_2O_3$水溶液(300 mL)且用CH_2Cl_2萃取水相。將經合併之有機相用H_2O洗滌兩次，接著用飽和NaCl水溶液洗滌，經Na_2SO_4乾燥且在減壓下蒸發以得到25.6 g(97%)呈淺棕色油狀之次磺醯胺(4.4)。

LC-MS: $C_{11}H_{14}NO_2S$之質量計算值：$[M+H]^+$ 224，實驗值：224；t_R=2.80 min。

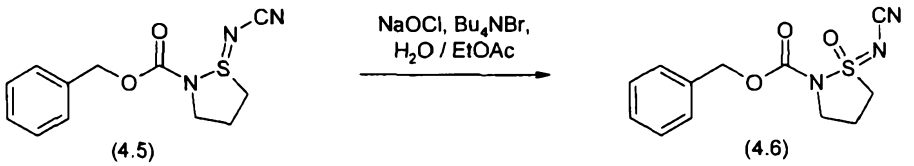
步驟4.5



在-50℃下將^{t}BuOCl(15 g，138.1 mmol)於MeOH(240 mL)中之溶液逐滴添加至氰胺鈉(8.84 g，138.1 mmol)於MeOH(480 mL)中之懸浮液中。在-50℃下於25 min內將次磺醯胺(4.4)(25.7 g，115.1 mmol)於MeOH(240 mL)中之溶液逐滴添加至此溶液中。將溶液在此溫度下攪拌1 h，接著添加H_2O(600 mL)且在10℃下繼續攪拌1 h。過濾所得懸浮液以得到第一批(7.4 g)所要亞磺醯亞胺基胺(4.5)。將濾液濃縮至約700 mL之體積，且過濾所得懸浮液。用H_2O洗滌殘餘物且使其自MeOH中結晶以得到第二批(7.4 g)亞磺醯亞胺基胺(4.5)(合併產量：14.8 g，46%)。

LC-MS: $C_{12}H_{14}N_3O_2S$之質量計算值：$[M+H]^+$ 264，實驗值：264；t_R=2.11 min。

步驟4.5

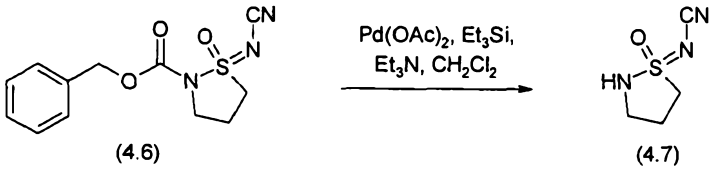


將NaOCl(約10%，410 g)之水溶液逐滴添加至亞磺醯亞胺基胺(4.5)(18.2 g，69.1 mmol)及Bu_4NBr(0.9 g，2.7

mmol)於EtOAc(450 mL)中之懸浮液中。將兩相溶液在周圍溫度下攪拌1 h，接著使各相分離且用EtOAc萃取水相。將經合併之有機相用H_2O洗滌，經Na_2SO_4乾燥且在減壓下蒸發以得到15.4 g(72%)磺醯亞胺基胺(4.6)。

LC-MS: $C_{12}H_{14}N_3O_3S$之質量計算值：$[M+H]^+$ 280，實驗值：280；t_R=2.29 min。

步驟4.6

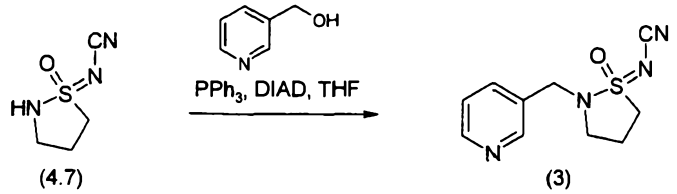


(4.6) (4.7)

將Et_3N(3.08 g，30.4 mmol)於CH_2Cl_2(60 mL)中之溶液逐滴添加至Et_3Si(10.6 g，91.3 mmol)及$Pd(OAc)_2$(0.7 g，3 mmol)於CH_2Cl_2(120 mL)中之溶液中。將磺醯亞胺基胺(4.6)(8.5 g，30.4 mmol)於CH_2Cl_2(60 mL)中之溶液逐滴添加至所得深色溶液中。將此溶液在周圍溫度下攪拌1 h，接著在減壓下濃縮。藉由急驟管柱層析(SiO_2；CH_2Cl_2/MeOH 20:1)純化殘餘物以得到2.6 g(59%)磺醯亞胺基胺(4.7)。

LC-MS: $C_4H_8N_3OS$之質量計算值：$[M+H]^+$ 146，實驗值：146；t_R=0.97 min。

步驟4.7



(4.7) (3)

在0℃下將DIAD(0.3 g，1.4 mmol)於THF(5 mL)中之溶液逐滴添加至聚合物鍵結PPh_3(3.2 mmol/g，1.4 mmol)於THF(15 mL)中之懸浮液中，且將懸浮液在此溫度下保持15 min。逐滴添加3-(羥基甲基)吡啶於THF(5 mL)中之溶液，接著在5分鐘後添加磺醯亞胺基胺(4.7)(77 mg，0.7 mmol)於THF(5 mL)中之溶液。將懸浮液溫至周圍溫度且在此溫度下保持16 h。藉由過濾移除聚合樹脂且在減壓下濃縮濾液。藉由急驟管柱層析(SiO_2，CH_2Cl_2/MeOH 40:1)純化殘餘物以得到97 mg(56%)所要磺醯亞胺基胺(3)。

LC-MS: $C_{10}H_{13}N_4OS$之質量計算值：$[M+H]^+$ 237，實驗值：237；t_R=0.74 min。

B. 對抗害蟲之作用的生物實例

一般條件

若未另外說明，則如下製備大部分測試溶液：

將活性化合物以所要濃度溶解於1:1(體積：體積)蒸餾水：丙酮之混合物中。在使用當天製備測試溶液(且若未另外說明，則一般而言濃度係以重量/體積計)。

B.1 棉鈴象鼻蟲(棉鈴象甲)

為評價對棉鈴象鼻蟲(棉鈴象甲)之控制，測試單元由容納昆蟲膳食及20-30個棉鈴象甲卵之24孔微量滴定盤組成。

使用含有75% v/v水及25% v/v DMSO之溶液來調配化合物。以兩次重複實驗，使用定製的微型霧化器將不同濃度之20 µl經調配化合物噴灑至昆蟲膳食上。

施用後，將微量滴定盤在約23 ± 1℃及約50 ± 5%相對濕度下培育5天。接著視覺上評定卵及幼蟲死亡率。

在此測試中，與未經處理之對照相比，第1、4、11、14、15、16、17、18、19、29、32、39、40、44、47、48、49、52、60、84及85號化合物實例(上述表E.1、表E.2及表E.3中給出)以2500 ppm顯示超過75%之死亡率。

B.2 蠶豆修尾蚜

為評價經由接觸或全身性方式對蠶豆修尾蚜之控制，測試單元由容納寬蠶豆葉圓片之24孔微量滴定盤組成。

使用含有75% v/v水及25% v/v DMSO之溶液來調配化合物。以兩次重複實驗，使用定製的微型霧化器將不同濃度之2.5 µl經調配化合物噴灑至圓葉片上。

施用後，使圓葉片經空氣乾燥且將5-8隻成年蚜蟲置於微量滴定盤孔內側之圓葉片上。接著使蚜蟲在經處理之圓葉片上吮食且在約23 ± 1℃及約50 ± 5%相對濕度下培育5天。接著視覺上評定蚜蟲死亡率及繁殖力。

在此測試中，與未經處理之對照相比，第1、2、4、5、7、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、29、32、33、39、43、60、67、73、74、75、84、85及90號化合物實例(上述表E.1、表E.2及表E.3中給出)以2500 ppm顯示超過75%之死亡率。

B.3a 桃蚜I

為評價經由全身方式對桃蚜之控制，測試單元由容納人工膜下之液體人工膳食的96孔微量滴定盤組成。

使用含有75% v/v水及25% v/v DMSO之溶液來調配化合物。以兩次重複實驗，使用定製吸管將不同濃度之經調配化合物吸移至蚜蟲膳食中。

施用後，將5-8隻成年蚜蟲置於微量滴定盤孔內側之人工膜上。接著使蚜蟲在經處理之蚜蟲膳食上吮食且在約23±1℃及約50±5%相對濕度下培育3天。接著視覺上評定蚜蟲死亡率及繁殖力。

在此測試中，與未經處理之對照相比，第1、11及17號化合物實例(上述表E.1、表E.2及表E.3中給出)以300 ppm顯示超過75%之死亡率。

B.3b 桃蚜II

將活性化合物調配於50:50丙酮：水(體積:體積)及100 ppm Kinetica™界面活性劑中。

藉由將受侵染之葉段置於測試植物之頂部而以約40隻實驗室飼養之蚜蟲侵染第二對葉片期之胡椒植物(變種「加州王(California Wonder)」)。24小時後移除葉段。將完整植物之葉片浸入測試化合物之梯度溶液中且使其乾燥。將測試植物在約25℃及約20%-40%相對濕度下維持於螢光下(24小時光週期)。5天後測定相對於對照植物上之死亡率，經處理植物上之蚜蟲死亡率。

在此測試中，與未經處理之對照相比，第1、11、12、13、14、15、17、18、19、26、29、43、60、84、85及90號化合物實例(上述表E.1、表E.2及表E.3中給出)以300 ppm顯示超過75%之死亡率。

B.4　豇豆蚜(黑豆蚜(*aphis craccivora*))

將活性化合物以所要濃度溶解於1:1(體積:體積)蒸餾水:丙酮之混合物中。在使用當天製備測試溶液。

在已記錄害蟲蟲口後，對經約100-150隻各個階段之蚜蟲定殖之盆栽豇豆植物噴霧。在24、72及120小時後評定蟲口減少。

在此測試中，與未經處理之對照相比，第1、2、4、5、10、11、12、13、14、15、17、18、19、29、39、43、44、48、52、60、73、84、85、86、90及97號化合物實例(上述表E.1、表E.2及表E.3中給出)以300 ppm顯示超過75%之死亡率。

B.5　棉蚜I

將活性化合物調配於50:50(體積：體積)丙酮:水及100 ppm Kinetica™界面活性劑中。

藉由將來自主群落之受嚴重侵染之葉片置於各子葉之頂部而侵染子葉期之棉花植物(每盆一株植物)。將蚜蟲轉移至宿主植物隔夜且移除用於轉移蚜蟲之葉片。將子葉浸於測試溶液中且使其乾燥。5天後進行死亡率計數。

在此測試中，與未經處理之對照相比，第1、2、11、12、14、15、17、18、26、29、60、84、85及90號化合物實例(上述表E.1、表E.2及表E.3中給出)以300 ppm顯示超過75%之死亡率。

B.6　蘭花薊馬

自持續維持於實驗室條件下之群落獲得用於生物檢定之

蘭花薊馬成蟲。出於測試目的，在丙酮:水(體積：體積)之1:1混合物加上0.01%(體積：體積)Kinetic®界面活性劑中將測試化合物稀釋至300 ppm(化合物重量:稀釋劑體積)之濃度。

藉由使用浸花技術(floral-immersion technique)評價各化合物之薊馬效能。使用塑膠皮氏培養皿(petri dish)作為測試場所。將個別、完整蘭花之所有花瓣浸入處理溶液中且使其乾燥。將經處理之花連同10-15隻成年薊馬一起置於個別皮氏培養皿中。接著用蓋子覆蓋皮氏培養皿。將所有測試場所保持在持續光照及約28℃之溫度下歷時檢定之持續時間。4天後，對每朵花上及沿各皮氏培養皿之內壁的活薊馬數目進行計數。自預處理之薊馬數目外推薊馬死亡率水平。

在此測試中，與未經處理之對照相比，第1、2、4、11、14、15、17、18、19、29、39、60、77及86號化合物實例(上述表E.1、表E.2及表E.3中給出)以300 ppm顯示超過75%之死亡率。

B.7 稻綠葉蟬(二點黑尾葉蟬(*Nephotettix virescens*))

在噴霧前24小時清潔且洗滌稻幼苗。將活性化合物調配於50:50丙酮：水(體積：體積)中，且添加0.1%(體積/體積)界面活性劑(EL 620)。以5 ml測試溶液對盆栽稻幼苗進行噴霧，經空氣乾燥，置於籠中且用10隻成蟲接種。將經處理之稻植物保持於約28-29℃及約50-60%相對濕度下。在72小時後記錄死亡率百分比。

在此測試中，與未經處理之對照相比，第1、5、11、12、13、14、15、17、18、19、29、39、40、60及84號化合物實例(上述表E.1、表E.2及表E.3中給出)以300 ppm顯示超過75%之死亡率。

201012817

發明專利說明書

（本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫）

※ 申請案號：98120881

※ 申請日：98、6、22　　※IPC 分類：~~C[illegible];~~ A01N 43/40

C07D 417/06
A01N 43/80
A01N 43/40
A01P 5/00
A01P 7/04

一、發明名稱：（中文/英文）

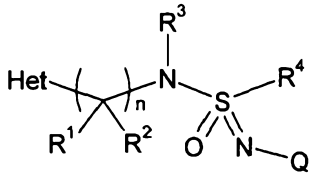
對抗動物害蟲之磺醯亞胺基胺(SULFOXIMINAMIDE)化合物

SULFOXIMINAMIDE COMPOUNDS FOR COMBATING ANIMAL PESTS

二、中文發明摘要：

本發明係關於式(I)之磺醯亞胺基胺(sulfoximinamid)化合物，其對映異構體、非對映體及鹽，及包含該等化合物之組合物。本發明亦關於該等磺醯亞胺基胺化合物、其鹽或包含其之組合物用於對抗動物害蟲之用途。此外，本發明亦關於施用該等磺醯亞胺(sulfoximine)化合物之方法。

本發明之磺醯亞胺基胺化合物係由下式I定義：



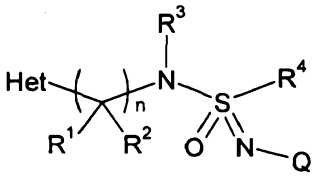
(I)　　(式I)

其中Q、Het、R^1、R^2、R^3、R^4及n如本說明書中所定義。

三、英文發明摘要：

The invention relates to sulfoximinamid compounds of formula (I), to the enantiomers, diastereomers and salts thereof and to compositions comprising such compounds. The invention also relates to the use of the sulfoximinamid compounds, of their salts or of compositions comprising them for combating animal pests. Furthermore the invention relates also to methods of applying such sulfoximine compounds.

The sulfoximinamid compounds of the present invention are defined by the following formula I:

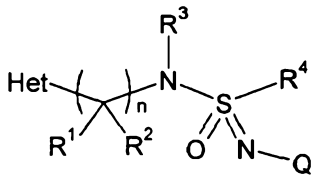


(I) formula (I)

wherein Q, Het, R^1, R^2, R^3, R^4 and n are defined as in the description.

七、申請專利範圍：

1. 一種式(I)之磺醯亞胺基胺(sulfoximinamide)化合物：



(I)

其中：

Q 為NO_2或CN；

n 為0、1或2；

R^1、R^2係彼此獨立地且與n無關地選自氫、鹵素、C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6烷氧基、CN、NO_2、$C(O)R^c$、$C(O)OR^a$、$C(O)NR^aR^b$、$C(S)NR^aR^b$或$S(O)_mR^c$，其中：

上述基團中之碳原子可帶有1個、2個或3個基團R^d之任何組合；或

R^1及R^2連同所連接之碳原子一起形成3員至6員碳環，其中：

該環之碳原子可帶有1或2個基團R^d之任何組合；

R^3 係選自氫、C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6烷氧基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、$C(O)R^c$、$C(O)OR^a$、$C(O)NR^aR^b$、$C(S)NR^aR^b$、SO_mR^c或NR^e，其中：

上述基團之碳原子可帶有1個、2個或3個基團R^d之任何組合；

R^4 係選自C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6

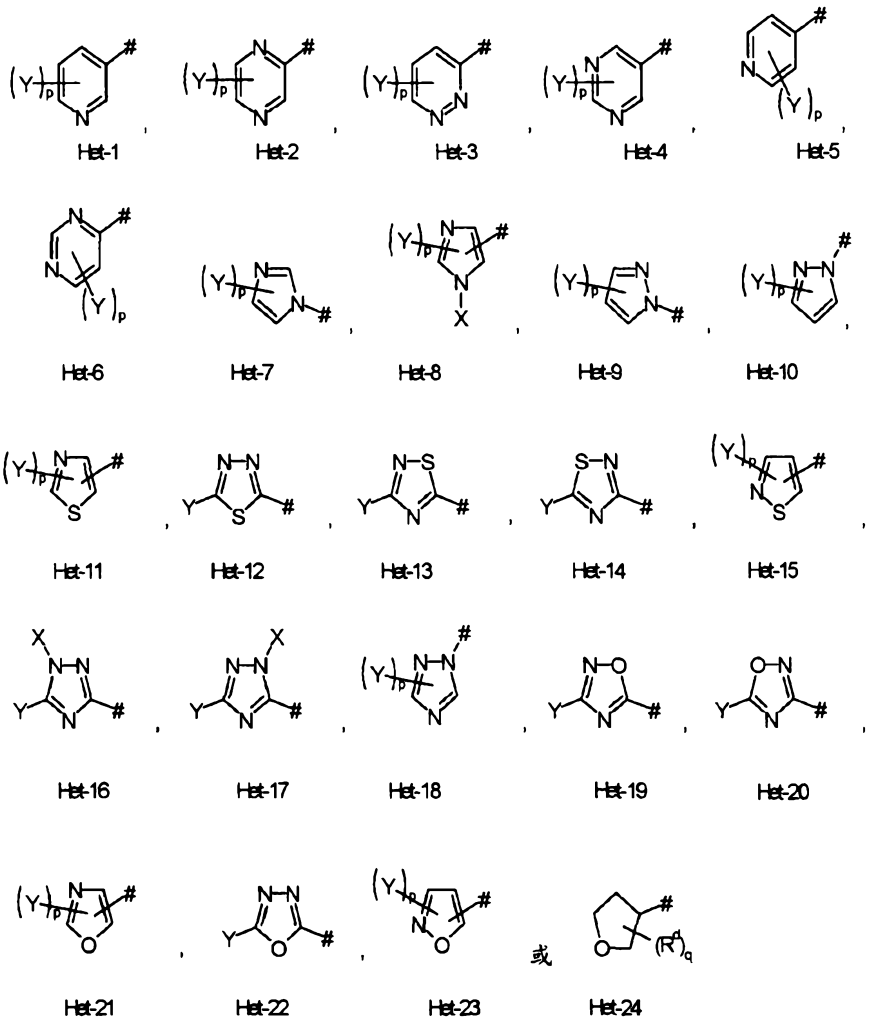
炔基或NR^eR^f，其中：

上述基團中之碳原子可帶有1個、2個或3個基團R^d之任何組合；

或

R^3及R^4連同所鍵結之氮及硫原子一起形成飽和或不飽和4員、5員或6員雜環，視情況含有選自N、O、S之另一雜原子，而該雜環之碳原子可視情況帶有1或2個基團R^d之任何組合，而該另一N原子視情況可帶有R^e；

Het係選自：



其中#表示式(I)中之鍵，且

X 係選自氫、C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵烷基、C_3-C_6環烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6鹵烯基、C_2-C_6炔基、C_2-C_6鹵炔基、$C(O)R^c$、$C(O)OR^5$、$C(O)NR^aR^b$、$C(S)NR^aR^b$或$S(O)_mR^c$，其中：

上述基團中之碳原子可帶有1個、2個或3個基團R^d之任何組合；

Y 係選自鹵素、C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6烷氧基、CN、NO_2、$S(O)_mR^c$、$C(O)R^c$、$C(O)OR^a$、$C(O)NR^aR^b$或$C(S)NR^aR^b$，其中：

上述基團中之碳原子可帶有1個、2個或3個基團R^d之任何組合；

p 為0、1或2；

q 為0、1或2；

其中：

R^a、R^b係彼此獨立地選自氫、C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基、C_3-C_6環烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6鹵烯基或C_3-C_6炔基；

R^c 係選自C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基、C_3-C_6環烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6鹵烯基或C_2-C_6炔基；

R^d 係選自鹵素、C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基、C_3-C_6環烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6鹵烯基或C_2-C_6炔基、C_1-C_6烷氧基、C_2-C_6烯氧基、C_2-C_6炔氧基、C_1-C_6鹵烷氧基

或C_1-C_6烷硫基；

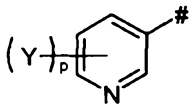
R^e、R^f係彼此獨立地選自氫、C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基、C_3-C_6環烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6鹵烯基、C_3-C_6炔基、$C(O)R^c$、$C(O)OR^a$、$C(O)NR^aR^b$或$C(S)NR^aR^b$；

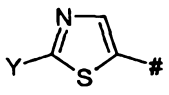
m 為0、1或2；

或其農業上或獸醫學上可接受之鹽、對映異構體或非對映體。

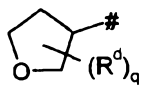
2. 如請求項1之式(I)磺醯亞胺基胺化合物，其中：

Het係選自：


Het-1


Het-11a

或


Het-24，

其中：

Y 係選自鹵素、C_1-C_4鹵烷基或C_1-C_4烷基；

p 為0、1或2；

R^d 係選自鹵素、C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基、C_3-C_6環烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6鹵烯基或C_2-C_6炔基、C_1-C_6烷氧基、C_2-C_6烯氧基、C_2-C_6炔氧基、C_1-C_6鹵烷氧基或C_1-C_6烷硫基；

q 為0、1或2。

3. 如請求項1或2之式(I)磺醯亞胺基胺化合物，其中：

Q為CN。

4. 如請求項1或2之式(I)磺醯亞胺基胺化合物，其中：

n為0。

5. 如請求項1或2之式(I)磺醯亞胺基胺化合物，其中：

n為1，

R^1、R^2係彼此獨立地且與n無關地選自氫、C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基或C_3-C_6環烷基。

6. 如請求項1或2之式(I)磺醯亞胺基胺化合物，其中：

R^3 係選自氫、C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6鹵烷基或C_4-C_6環烷基烷基。

7. 如請求項1或2之式(I)磺醯亞胺基胺化合物，其中：

R^3 係選自氫、甲基、乙基、丙基、異丙基、環丙基、第三丁基或環丙基甲基。

8. 如請求項1或2之式(I)磺醯亞胺基胺化合物，其中：

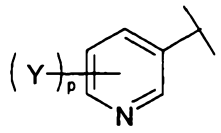
R^4 為甲基或乙基。

9. 如請求項1或2之式(I)磺醯亞胺基胺化合物，其中：

R^3及R^4連同所鍵結之氮及硫原子一起形成飽和或不飽和5員或6員雜環，而該雜環之碳原子可視情況帶有1或2個基團R^d之任何組合，其中：

R^d 係選自鹵素、C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵烷基、C_3-C_6環烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6鹵烯基或C_2-C_6炔基、C_1-C_6烷氧基、C_2-C_6烯氧基、C_2-C_6炔氧基、C_1-C_6鹵烷氧基或C_1-C_6烷硫基。

10. 如請求項1或2之式(I)磺醯亞胺基胺化合物，其中：

Het為 

，其中：

Y　係選自鹵素、C_1-C_4鹵烷基或C_1-C_4烷基，且

p　為0、1或2；

Q　為CN；

n　為0或1；

R^1、R^2係彼此獨立地選自氫、甲基、乙基或三氟甲基，或

R^1及R^2連同所連接之碳原子一起形成環丙烷；

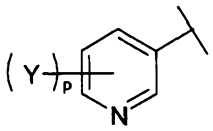
R^3　係選自氫、甲基、乙基、丙基、異丙基、環丙基、第三丁基或環丙基甲基；

R^4　為甲基或乙基；

或

R^3及R^4連同所鍵結之氮及硫原子一起形成飽和4員、5員或6員雜環。

11. 如請求項1或2之式(I)磺醯亞胺基胺化合物，其中：

Het為  ，其中：

Y　係選自鹵素或C_1-C_4鹵烷基；

p　為1；

Q　為CN；

N　為0；

R^3　係選自氫、甲基、乙基、丙基、異丙基、環丙基、第三丁基或環丙基甲基；

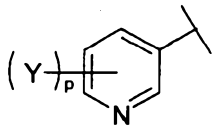
R^4　為甲基或乙基；

或

R^3及R^4連同所鍵結之氮及硫原子一起形成飽和4員、5員

或6員雜環。

12. 如請求項1或2之式(I)磺醯亞胺基胺化合物，其中：

Het為  ，其中：

Y 係選自鹵素或C_1-C_4鹵烷基；

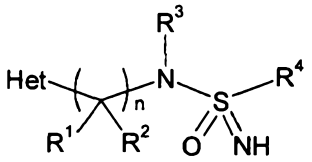
p 為1；

Q 為CN；

n 為0；

R^3及R^4連同所鍵結之氮及硫原子一起形成未經取代之異噻唑啶或未經取代之[1,2]硫氮雜環己烷(thiazinane)環。

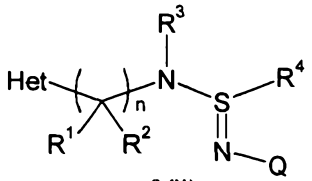
13. 一種式(II)化合物：



(II)

其中n、Het、R^1、R^2、R^3及R^4如請求項1中所定義。

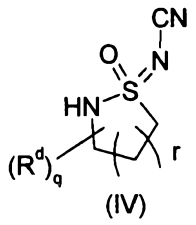
14. 一種式(VII)化合物：



(VII)

其中n、Het、R^1、R^2、R^3、R^4及Q如請求項1中所定義。

15. 一種式(IV)化合物：



(IV)

其中：

r為1或2；

q為0、1或2；

R^d如請求項1中所定義。

16. 一種組合物，其包含至少一種如請求項1至13中任一項之式I磺醯亞胺基胺化合物或其對映異構體、非對映體或鹽及至少一種惰性液體及/或固體載劑。

17. 一種用於對抗動物害蟲之農業或獸醫學組合物，其包含殺蟲有效量之至少一種如請求項1至13中任一項之式I磺醯亞胺基胺化合物或其對映異構體、非對映體或農業上或獸醫學上適用之鹽，及至少一種惰性液體及/或固體可接受之載劑，及若需要，至少一種界面活性劑。

18. 一種對抗或控制昆蟲、蜘蛛類(arachnids)或線蟲之方法，其包含使昆蟲、蜘蛛類或線蟲或其食物來源、棲息地或滋生地(breeding grounds)與殺蟲有效量之至少一種如請求項1至13中任一項之式I磺醯亞胺基胺化合物或其對映異構體、非對映體或鹽或包含至少該種式I化合物之組合物接觸。

19. 一種保護生長之植物免遭昆蟲、蜘蛛類或線蟲侵襲或侵染(infestation)之方法，其包含使植物或植物生長之土壤或水與殺蟲有效量之至少一種如請求項1至13中任一項

之式I磺醯亞胺基胺化合物或其對映異構體、非對映體或鹽或包含至少該種式I化合物之組合物接觸。

20. 如請求項18或19之方法，其中該動物害蟲係半翅目(*Hemiptera*)或纓翅目(*Thysanoptera*)。

21. 一種保護種子免遭土壤昆蟲侵害及保護幼苗之根及嫩芽(shoots)免遭土壤及葉片昆蟲侵害之方法，其包含使該等種子在播種前及/或催芽(pregermination)後與至少一種如請求項1至13中任一項之式I磺醯亞胺基胺化合物或其對映異構體、非對映體或鹽或包含至少該化合物之組合物接觸。

22. 如請求項21之方法，其中該式I磺醯亞胺基胺化合物係以每100公斤種子100毫克至10公斤之量施用。

23. 如請求項21或22之方法，其中所得植物之根及嫩芽受到保護。

24. 一種種子，其每100公斤種子包含0.1公克至10公斤之量的如請求項1至13中任一項之式I磺醯亞胺基胺化合物或其對映異構體、非對映體或鹽。

25. 一種如請求項1至13中任一項之式I化合物或其對映異構體、非對映體或獸醫學上可接受之鹽的用途，其用於對抗動物體內及體表之寄生蟲。

26. 一種治療、控制、預防或保護動物免遭寄生蟲侵染或感染之方法，其包含向該等動物經口、局部或非經腸投與或施用殺寄生蟲有效量之如請求項1至13中任一項之式I磺醯亞胺基胺化合物或其對映異構體、非對映體及/或獸

醫學上可接受之鹽。

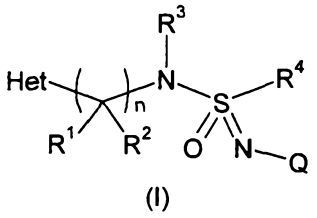
27. 一種製備供治療、控制、預防或保護動物免遭寄生蟲侵染或感染之組合物的方法，該組合物包含殺寄生蟲有效量之如請求項1至13中任一項之式I磺醯亞胺基胺化合物或其對映異構體、非對映體及/或獸醫學上可接受之鹽。

四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：(無)

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：



(I)

式(I)