

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：95142924

※ 申請日期：95.11.21

※IPC 分類：

A01N 43/80
C07D 275/04
C07D 275/06

一、發明名稱：(中文/英文)

利用3-胺基-1,2-苯并異噻唑衍生物之殺蟲方法

INSECTICIDAL METHODS USING 3-AMINO-1,2-BENZOISOTHIAZOLE
DERIVATIVES

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

德商巴地斯顏料化工廠

BASF AKTIENGESELLSCHAFT

代表人：(中文/英文)

1. 貝蕾爾
BIELLER

2. 寇斯特
KOESTER

住居所或營業所地址：(中文/英文)

德國來恩河勞域沙芬市卡羅玻斯克街

CARL-BOSCH-STRASSE, 67056 LUDWIGSHAFEN, GERMANY

國 籍：(中文/英文)

德國 GERMANY

三、發明人：(共 8 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 馬席斯 波曼
POHLMAN, MATTHIAS
2. 沃夫岡 凡 狄恩
VON DEYN, WOLFGANG
3. 佛洛里恩 凱瑟
KAISER, FLORIAN
4. 麥可 雷克
RACK, MICHAEL
5. 亨利克斯 瑪利亞 馬提納斯 巴斯提恩斯
BASTIAANS, HENRICUS MARIA MARTINUS
6. 道格拉斯 D 安斯波
ANSPAUGH, DOUGLAS D.
7. 黛博拉 L 柯柏森
CULBERTSON, DEBORAH L.
8. 亨利 汎 杜爾 卡特
COTTER, HENRY VAN TUYL

國 籍：(中文/英文)

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

四、聲明事項：

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

☒ 申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

☒ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1. 美國；2005年11月21日；60/738,443

2.

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1.

2.

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

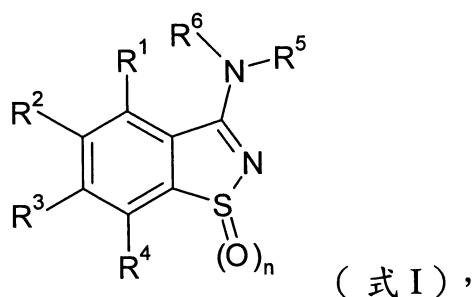
☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

九、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於一種對抗或控制昆蟲、蛛形類或線蟲之方法，其包含使昆蟲、蛛形蟲或線蟲或其食物來源、棲息地或繁殖場與殺蟲有效量之至少一種式I化合物或包含至少一種式I化合物的組合物接觸，以及一種保護種子免受土壤昆蟲侵害及保護幼苗之根及芽免受土壤及食葉昆蟲侵害的方法，其包含在播種前及/或發芽處理後使種子與式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含至少一種式I化合物之組合物接觸：



其中

n 為 0、1 或 2；

R¹ 為氫、硝基、氰基、疊氮基、胺基、鹵素、磺醯胺基、次磺醯胺基、亞磺醯胺基、C(=O)R^{1a}、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₈環烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆鹵烷氧基、C₁-C₆烷硫基、(C₁-C₆烷基)胺基、二(C₁-C₆烷基)胺基、C₁-C₆烷基亞磺醯基或C₁-C₆烷基磺醯基，其中最後提及之十一個基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由

下列基團組成之群的基團：氰基、硝基、胺基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄烷基亞磺基、C₁-C₄烷基磺基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄鹵烷硫基、(C₁-C₄烷氧基)羰基、(C₁-C₄烷基)胺基、二(C₁-C₄烷基)胺基、C₃-C₈環烷基及苯基，苯基可能未經取代、經部分或完全鹵化及/或帶有1、2或3個彼此獨立地選自由下列基團組成之群的取代基：C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵烷基、C₁-C₄烷氧基及C₁-C₄鹵烷氧基，且其中

R^{1a} 係選自由下列基團組成之群：氫、羥基、C₁-C₆烷氧基、胺基、C₁-C₆烷基、芳基、芳基-C₁-C₆烷基、(C₁-C₆烷基)-胺基、二-(C₁-C₆烷基)-胺基、3至7員雜芳基或雜芳基-C₁-C₄烷基，其中雜芳基環含有作為環成員之1、2或3個選自由下列組成之群的雜原子：氮、氧、硫、基團SO、SO₂或N-Rⁿ，其中Rⁿ為氫、C₁-C₆烷基或(C₁-C₆烷基)-羰基；

R²、R³及R⁴係彼此獨立地選自由下列基團組成之群：氫、鹵素、氰基、疊氮基、硝基、C₁-C₆烷基、C₃-C₈環烷基、C₁-C₄鹵烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄烷基亞磺基、C₁-C₄烷基磺基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄鹵烷硫基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、(C₁-C₄烷氧基)羰基、胺基、(C₁-C₄烷基)胺基、二(C₁-C₄烷基)胺基、胺基羰基、(C₁-C₄烷基)胺基羰基、二(C₁-C₄烷基)胺基羰基、磺基、磺基胺基、次磺基胺基、硫

基胺基及 $C(=O)-R^{2a}$ 或 $C(=O)-R^{3a}$ 或 $C(=O)-R^{4a}$ ，且其中 R^{2a} 或 R^{3a} 或 R^{4a} 係選自由下列基團組成之群：氫、羥基、 C_1-C_6 烷氧基、胺基、 C_1-C_6 烷基、芳基、芳基- C_1-C_6 烷基、 $(C_1-C_6$ 烷基)-胺基、二 $(C_1-C_6$ 烷基)-胺基、3至7員雜芳基或雜芳基- C_1-C_4 烷基，其中雜芳基環含有作為環成員之1、2或3個選自由下列組成之群的雜原子：氮、氧、硫、基團 SO 、 SO_2 或 $N-R^n$ ，其中 R^n 為氫、 C_1-C_6 烷基或 $(C_1-C_6$ 烷基)-羰基；

R^5 係選自由下列基團組成之群： OR^{5a} 、 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_3-C_{10} 環烷基，其中最後提及之四個基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1-4個選自由下列基團組成之群的基團： C_1-C_{10} 烷氧基、 C_1-C_{10} 烷硫基、 C_1-C_{10} 烷基亞磺基、 C_1-C_{10} 烷基磺基、 C_1-C_{10} 鹵烷氧基、 C_1-C_{10} 鹵烷硫基、 $(C_1-C_{10}$ 烷氧基)羰基、氰基、硝基、胺基、 $(C_1-C_{10}$ 烷基)胺基、二- $(C_1-C_{10}$ 烷基)胺基、 C_3-C_{10} 環烷基及苯基，苯基可未經取代、經部分或完全鹵化及/或帶有1-3個選自由下列基團組成之群的取代基： C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_1-C_6 烷氧基及 C_1-C_6 鹵烷氧基，且其中

R^{5a} 係選自氫、 C_1-C_{10} 烷基、 C_1-C_{10} 鹼基、 C_3-C_{10} 環烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、芳基、芳基- C_1-C_4 烷基、雜芳基及雜芳基- C_1-C_4 烷基、雜環基或雜環基- C_1-C_4 烷基，且其中該等基團之碳原子可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3

個選自由下列基團組成之群的基團：氰基、硝基、胺基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺基、 C_1 - C_4 烷基磺基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、(C_1 - C_4 烷氧基)羰基、(C_1 - C_4 烷基)胺基、二(C_1 - C_4 烷基)胺基及 C_3 - C_8 環烷基；

R^6 係選自由下列基團組成之群： C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_2 - C_{10} 炔基、 C_3 - C_{10} 環烷基，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1-4個選自由下列基團組成之群的基團： C_1 - C_{10} 烷氧基、 C_1 - C_{10} 烷硫基、 C_1 - C_{10} 烷基亞磺基、 C_1 - C_{10} 烷基磺基、 C_1 - C_{10} 鹵烷氧基、 C_1 - C_{10} 鹵烷硫基、(C_1 - C_{10} 烷氧基)羰基、氰基、硝基、胺基、(C_1 - C_{10} 烷基)胺基、二-(C_1 - C_{10} 烷基)胺基、 C_3 - C_{10} 環烷基及苯基，苯基可能未經取代、經部分或完全鹵化及/或帶有1-3個選自由下列基團組成之群的取代基： C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基，或

R^5/R^{5a} 與 R^6 可接合以形成3-10員環，其視情況經取代且除視情況經取代之 C_1 - C_5 烷基以外，視情況獨立地含有1至3個N、 NR^n 、O、S、SO、 SO_2 部分，其可視情況不飽和，且其中 R^n 為氫、 C_1 - C_6 烷基或(C_1 - C_6 烷基)-羰基；

或其對映異構物或非對映異構物、鹽或酯。

【先前技術】

儘管當前市售殺蟲劑、殺蟎劑及殺線蟲劑有效，但仍然

發生由昆蟲、蛛形蟲及線蟲所致之對生長中與收穫之作物的損害。因此，對開發新穎的殺蟲劑、殺蟎劑及殺線蟲劑存在持續需要。

【發明內容】

因此，本發明之一目標為提供用於控制昆蟲、蛛形蟲或線蟲並保護生長中之植物免受昆蟲、蛛形蟲或線蟲攻擊或侵襲的新穎殺蟲組合物、新穎化合物及新穎方法，以及用於保護種子免受土壤昆蟲侵害及保護幼苗之根及芽免受土壤及食葉昆蟲侵害的新穎方法。

吾人已發現該等目標可由式I化合物來達成。

視取代模式而定，式I化合物可含有一或多個對掌性中心，在此情況下其以對映異構物或非對映異構物混合物形式存在。本發明之主題物質不僅為含有該等混合物之組合物，而且亦為彼等含有純對映異構物或非對映異構物之組合物。

DE 1915387、WO 03/87072、JP 06220030、DE 1670920及DE 1545842中尤其已描述一些式I化合物。然而尚未揭示式I化合物之殺蟲、殺蟎或殺線蟲之活性。

Drabek已在EP 207891、EP 191734、DE 3544436、EP 138762、EP 133418及EP 110829中對胺基-1,2-苯并異噻唑及醯化胺基-1,2-苯并異噻唑化合物就其殺蟲活性加以描述，或在EP 86748中對3-甲脒基苯并異噻唑1,1-二氧化物就其相同用途加以描述。JP 01319467描述用於殺蟲目的之N-醯化胺基-苯并異噻唑及其1,2-二氧化物衍生物的製備。

EP 0033984中已描述基於經單取代之3-胺基-1,2-苯并異噻唑-1,1-二氧化物衍生物的磺醯基化合物及殺蚜組合物。

本發明之內在問題為需要用於殺蟲用途之具有優異功效及良好化學及物理化學穩定性的新穎化合物。

此問題由本申請案藉由將N,N-二取代3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物用作殺蟲化合物來解決。其展示比彼等先前技術中所使用之衍生物尤其更佳之穩定性，且具有較佳之殺蟲活性。

在本說明書及申請專利範圍中，將提及應定義為具有下列含義之眾多術語：

如本文所使用之"鹽"包括化合物I與下列物質之加合物：順丁烯二酸、二順丁烯二酸、反丁烯二酸、二反丁烯二酸、甲烷次磺酸、甲烷磺酸及丁二酸。此外，作為"鹽"所包括者為彼等可與(例如)胺、金屬、鹼土金屬鹼或第四銨鹼(包括兩性離子)所形成之鹽。適用作成鹽物之金屬及鹼土金屬氫氧化物包括鋁、鋁、鎳、銅、錳、鈷、鋅、鐵、銀、鋰、鈉、鉀、鎂或鈣之鹽。其他成鹽物包括氯化物、硫酸鹽、乙酸鹽、碳酸鹽、氫化物及氫氧化物。合意的鹽包括化合物I與順丁烯二酸、二順丁烯二酸、反丁烯二酸、二反丁烯二酸及甲烷磺酸之加合物。

"鹵素"將用於意謂氟、氯、溴及碘。

如本文所使用之術語"烷基"係指具有1至6、1至8或1至10個碳原子之分枝或未分枝之飽和烴基，例如C₁-C₆烷基，諸如甲基、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-甲基丙基及1-乙基-2-甲基丙基。

如本文所使用之術語"鹵烷基"係指(如以上提及)具有1至6個碳原子之直鏈或支鏈烷基，其中如以上提及，該等基團中之一些或所有氫原子可由鹵素原子置換，例如C₁-C₂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、五氟乙基及七氟丙基。

"烷胺基"係指具有1至6個碳原子(如以上提及)經由氮鍵鍵結之直鏈或支鏈烷基。

類似地，"烷氧基"、"(烷基)羰基"、"烷基亞磺醯基"、"烷基磺醯基"、"烷硫基"或"烷胺基"係指具有1至6或1至8或1至10個碳原子(如以上提及)在烷基中之任何鍵處分別經由氧或硫鍵鍵結的直鏈或支鏈烷基。實例包括甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、甲硫基、乙硫基、丙硫基、異

丙硫基及正丁硫基。

如本文所使用之術語"烯基"意謂具有2至6個碳原子及任何位置之雙鍵的分枝或未分枝不飽和烴基，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

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

如本文所使用之術語"炔基"係指含有至少一個三鍵之分歧或未分歧不飽和烴基，諸如乙炔基、丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基及其類似基團。

芳基：單環或雙環狀5員至10員芳族環系統，例如苯基或萘基。

雜芳基：含有1至4個選自氧、硫及氮之雜原子的5員至10員雜芳族環系統，例如含有1至4個氮原子之5員雜芳基，諸如吡咯基、吡唑基、咪唑基、三唑基及四唑基；或

含有1至4個氮原子或1至3個氮原子及1個硫或氧原子之5員雜芳基，例如呋喃基、噻吩基、吡咯基、異噁唑基、異噻唑基、吡唑基、噁唑基、噻唑基、咪唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基及四唑基；或

含有1至4個氮原子或1至3個氮原子及1個硫或氧原子之5員雜芳基，其中兩個相鄰環碳原子或一個氮原子及一個相鄰碳原子可由丁-1,3-二烯-1,4-二基橋接；或含有1至4個氮原子或1至3個氮原子及1個硫或氧原子之6員雜芳基，例如2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、3-噻嗪基、4-噻嗪基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、5-嘧啶基、2-吡嗪基、1,3,5-三嗪-2-基及1,2,4-三嗪-3-基。

含有1至3個選自氮及氧之雜原子的飽和或部分飽和之單環或雙環狀5員至10員環系統意指(例如)含有1至3個選自氮

及氧之雜原子的飽和單環狀5員至7員環系統，諸如吡啶、嘧啶、吡咯啉、哌嗪、高哌嗪、嗎啉及哌啶；或

例如含有1至3個選自氮及氧之雜原子的飽和雙環狀7員至10員環系統，諸如1,4-二氮二環[4.3.0]壬烷、2,5-二氮二環[2.2.2]辛烷及2,5-二氮二環[2.2.1]庚烷。

環烷基：單環狀3員至6員、8員、10員或12員飽和碳原子環，例如C₃-C₈環烷基，諸如環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基及環辛基。

關於式I化合物之預期用途，在其本身或於組合中之各情況下，尤其優先選擇取代基之下列含義：

亦優先選擇其中R¹為鹵素、C(=O)R^{1a}、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₈環烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆鹵烷氧基之式I化合物，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由下列基團組成之群的基團：C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、(C₁-C₄烷氧基)羰基及C₃-C₈環烷基，且其中R^{1a}係選自由下列基團組成之群：氫、羥基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆鹵烷氧基、胺基、(C₁-C₆)烷基-胺基、二-(C₁-C₆)烷基-胺基、C₁-C₆烷基、芳基及芳基-C₁-C₆烷基。

尤其優先選擇其中R¹為鹵素、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆鹵烷氧基之式I化合物，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由C₁-C₄烷氧基及C₁-C₄鹵烷氧基組成之群的基團。

亦尤其優先選擇其中R¹為鹵素、較佳為氟或氯、最佳為

氮之式I化合物。

此外，尤其優先選擇其中 R^1 為 C_1 - C_6 烷氧基或 C_1 - C_6 鹵烷氧基之式I化合物。

優先選擇其中 R^2 、 R^3 及 R^4 為氮之式I化合物。

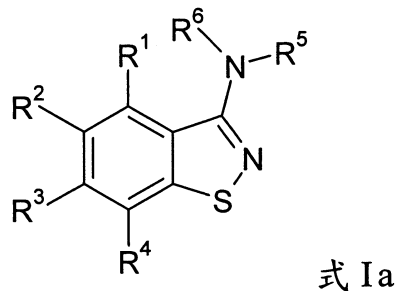
優先選擇其中 R^5 及 R^6 為 C_1 - C_6 烷基或 C_2 - C_6 炔基，尤其 C_1 - C_4 烷基之式I化合物。

亦優先選擇其中n為2之式I化合物。亦優先選擇其中n為0之式I化合物。尤其優先選擇其中n為2之式I化合物。

關於其用途，尤其優先選擇下表中所彙編之式I化合物。

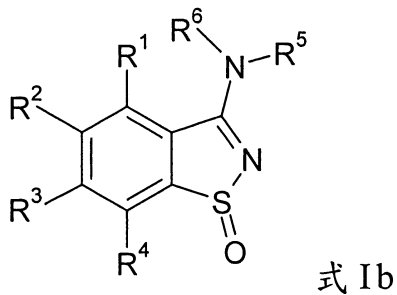
此外，表中就取代基所提及之基團當其本身獨立於其所提及之組合時為所述各別取代基的尤其較佳實施例。

式Ia之化合物



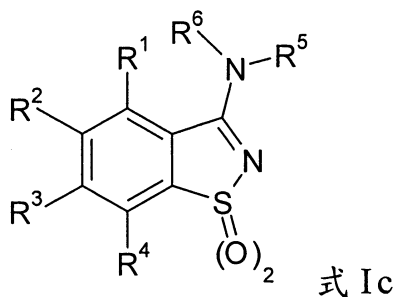
較佳為式Ia之化合物，其中在各情況下 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 對應於表1至178之列，且因此在各情況下 R^5 及 R^6 對應於表A 1至A 444之列。

式Ib之化合物：



較佳為式 Ib 之化合物，其中在各情況下 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 對應於表 179 至 356 之列，且因此在各情況下 R^5 及 R^6 對應於表 A 1 至 A 444 之列。

式 Ic：



較佳為式 Ic 之化合物，其中在各情況下 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 對應於表 357 至 534 之列，且因此在各情況下 R^5 及 R^6 對應於表 A 1 至 A 444 之 R^5 及 R^6 之列。

該等較佳實例係用於對抗或控制昆蟲、蛛形蟲或線蟲之方法中，該方法包含使昆蟲、蛛形蟲或線蟲或其食物來源、棲息地或繁殖場與殺蟲有效量之至少一種式 (Ia)、(Ib) 或 (Ic) 化合物或包含至少一種具有彼等如本文所定義之式之化合物的組合物接觸。其亦用於保護種子免受土壤昆蟲侵害及保護幼苗之根及芽免受土壤及食葉昆蟲侵害之方法中，該方法包含在播種前及/或發芽處理後使種子與至少一種式 (Ia)、(Ib) 或 (Ic) 化合物或包含至少一種具有彼等如本文所定義之式之化合物的組合物接觸。在不考慮任何優

先的情況下，一些個別化合物將於表之不同列中定義一次以上。

表 1：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 2：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 3：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 4：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 5：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 6：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 7：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 8：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2

為 H， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 9：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 10：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 11：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 12：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 13：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 14：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 15：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 16：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2

為 F， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 17：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 18：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 19：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 20：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 21：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 22：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 23：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 OCHF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 24：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2

為 F， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 25：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 26：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 27：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 28：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 29：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 30：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 31：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 32：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2

為 Cl, R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 33：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H, R^2 為 Cl, R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 34：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H, R^2 為 Cl, R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 35：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H, R^2 為 Cl, R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 36：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H, R^2 為 Cl, R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 37：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H, R^2 為 Br, R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 38：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H, R^2 為 Br, R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 39：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H, R^2 為 Br, R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 40：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H, R^2

為 Br， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 41：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 42：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 43：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 44：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 45：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 46：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 47：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 OCHF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 48：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2

為 Br， R^1 為 OCClF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 49：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 50：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 51：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 52：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 53：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 54：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 55：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 56：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所

定義；

表 57：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 58：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 59：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 60：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 61：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 62：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 63：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 64：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 65：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 66：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 67：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 68：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 69：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 70：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 OCHF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 71：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 OCClF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 72：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 73：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 74：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 75：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 76：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 77：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 78：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 79：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 80：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

- 表 81：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 82：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 83：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 84：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 85：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 86：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 87：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 88：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

- 表 89：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 90：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 91：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 92：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 93：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 94：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 OCHF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 95：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 OCClF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 96：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 97： 式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 98： 式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 99： 式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 100： 式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 101： 式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 102： 式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 103： 式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 104： 式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 105：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 106：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 107：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 108：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 109：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 110：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 111：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 112：式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 113： 式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 114： 式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 115： 式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 116： 式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 117： 式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 118： 式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 OCHF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 119： 式 Ia 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 OCClF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 120： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 121：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 121：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 123：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 124：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 125：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 126：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 127：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 128：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 129： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 130： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 131： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 132： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 133： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 134： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 135： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 136： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 137： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 138： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 139： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 140： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 141： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 OCHF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 142： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 OCClF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 143： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 144： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

- 表 145：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 146：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 147：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 148：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 149：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 150：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 151：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 152：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 153： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 154： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 155： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 156： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 157： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 158： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 159： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 160： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 161： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 162： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 163： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 164： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 165： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 166： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 167： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 168： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 169：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 170：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 171：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 172：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 173：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 174：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 175：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 176：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 177：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 178：式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 179：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 180：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 181：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 182：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 183：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 184：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 185：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 186：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 187：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 188：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 189：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 OCHF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 190：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 OCClF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 191：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 192：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 193： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 194： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 195： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 196： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 197： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 198： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 199： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 200： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 201： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 202： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 203： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 204： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 205： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 206： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 207： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 208： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 209：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 210：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 211：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 212：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 213：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 214：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 215：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 216：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 217： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 218： 式 Ia 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 219： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 220： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 221： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 222： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 223： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 224： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 225：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 226：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 227：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 228：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 229：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 230：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 231：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 232：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 233：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 234：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 235：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 236：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 237：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 238：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 239：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 240：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 241：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 242：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 243：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 244：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 245：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 246：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 247：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 248：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 OCHF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 249：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 OCClF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 250：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 251：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 252：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 253：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 254：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 255：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 256：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 257： 式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 258： 式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 259： 式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 260： 式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 261： 式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 262： 式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 263： 式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 264： 式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 265：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 266：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 267：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 268：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 269：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 270：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 271：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 272：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 OCHF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 273：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 OCClF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 274：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 275：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 276：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 277：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 278：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 279：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 280：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

- 表 281： 式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 282： 式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 283： 式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 284： 式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 285： 式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 286： 式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 287： 式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；
- 表 288： 式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 289：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 290：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 291：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 292：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 293：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 294：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 295：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 296：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 OCHF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 297：式 Ib 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 OCClF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 298：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 299：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 300：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 301：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 302：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 303：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 304：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 305： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 306： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 307： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 308： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 309： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 310： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 311： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 312： 式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 313：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 314：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 315：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 316：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 317：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 318：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 319：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 OCHF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 320：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 OCClF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 321：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 322：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 323：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 324：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 325：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 326：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 327：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 328：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 329：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 330：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 331：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 332：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 333：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 334：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 335：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 336：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 337：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 338：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 339：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 340：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 341：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 342：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 343：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 OCHF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 344：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 OCClF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 345：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 346：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 347：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 348：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 349：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 350：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 351：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 352：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 353：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 354：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 355：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 356：式 Ib 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 357：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 358：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 359：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 360：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 361：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 362：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 363：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 364：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 365：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 366：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 367：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 OCHF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 368：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 H， R^1 為 OCClF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 369：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 370：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 371：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 372：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 373：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 374：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 375：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 376：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 377：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 378：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 379：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 380：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 F， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 381：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 382：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 383：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 384：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 385：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 386：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 387：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 388：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 389：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 390：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 391：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 OCHF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 392：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Cl， R^1 為 OCClF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 393：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 394：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 395：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 396：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 397：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 398：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 399：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 400：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 401：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 402：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 403：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 404：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 Br， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 405：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 406：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 407：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 408：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 409：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 410：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 411：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 412：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 413：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 414：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 415：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 416：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^4 中之每一者為 H， R^2 為 J， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 417： 式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 418： 式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 419： 式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 420： 式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 421： 式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 422： 式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 423： 式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 424： 式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 425：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 426：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 427：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 H， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 428：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 429：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 430：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 431：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 432：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 433：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 434：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 435：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 436：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 437：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 438：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 439：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 F， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 440：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 441：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 442：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 443：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 444：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 445：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 446：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 447：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 448：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 449：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 450：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 451：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Cl， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 452：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 453：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 454：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 455：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 456：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 457： 式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 458： 式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 459： 式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 460： 式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 461： 式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 462： 式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 OCHF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 463： 式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 Br， R^1 為 OCClF_2 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 464： 式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 465：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 466：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 467：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 468：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 469：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 470：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 471：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 472：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 473：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 474：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 475：式 Ic 之化合物，其中 R^2 及 R^4 中之每一者為 H， R^3 為 J， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 476：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 477：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 478：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 479：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 480：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 481：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 482：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 483：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 484：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 485：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 486：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 H， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 487：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 488：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 489：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 490：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 491：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 492：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 493：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 494：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 495：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 496：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 497：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 498：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 F， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 499：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 500：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 501：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 502：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 503：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 504：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 505：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 506：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 507：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 508：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 509：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 510：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Cl， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 511：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 512：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 513： 式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 514： 式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 515： 式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 516： 式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 517： 式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 518： 式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 519： 式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 520： 式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 521：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 522：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 Br， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 523：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 CH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 524：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 C_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 525：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 CF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 526：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 F 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 527：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 Cl 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 528：式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 Br 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 529： 式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 J 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 530： 式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 OCH_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 531： 式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 OC_2H_5 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 532： 式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 OCF_3 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 533： 式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 $OCHF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

表 534： 式 Ic 之化合物，其中 R^3 及 R^2 中之每一者為 H， R^4 為 J， R^1 為 $OCClF_2$ 且其中 R^5 及 R^6 如表 A 之一列中所定義；

關於式 Ia、Ib 及 Ic 之表 A：

	R^5	R^6
A.1	CH_3	CH_3
A.2	CH_3	H_3C-CH_2
A.3	CH_3	$H_2C=CH$
A.4	CH_3	$H_3C-O-CH_2$
A.5	CH_3	$ClCH_2-CH_2$
A.6	CH_3	FCH_2-CH_2
A.7	CH_3	F_3C-CH_2

	R ⁵	R ⁶
A.8	CH ₃	Cl ₃ C-CH ₂
A.9	CH ₃	HO-CH ₂ -CH ₂
A.10	CH ₃	H ₃ C-O-CH ₂ -CH ₂
A.11	CH ₃	(CH ₃) ₂ CH
A.12	CH ₃	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.13	CH ₃	CN-CH ₂
A.14	CH ₃	CN-CH ₂ -CH ₂
A.15	CH ₃	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.16	CH ₃	Cl ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.17	CH ₃	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂
A.18	CH ₃	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)
A.19	CH ₃	H ₃ C-CH(CH ₃)-CH ₂
A.20	CH ₃	H ₂ C=C(CH ₃)-CH ₂
A.21	CH ₃	HC≡C-CH(CH ₃)
A.22	CH ₃	HC≡C-CH ₂
A.23	CH ₃	(CH ₃) ₃ C
A.24	CH ₃	HO
A.25	CH ₃	H ₃ C-O
A.26	CH ₃	H ₃ C-CH ₂ -O
A.27	CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-O
A.28	CH ₃	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -O
A.29	CH ₃	H ₂ C=CH-CH ₂ -O
A.30	CH ₃	H ₂ C=CH-CH ₂
A.31	CH ₃	HC≡C-CH ₂ -O
A.32	CH ₃	(CH ₃) ₃ C-O
A.33	CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -O
A.34	CH ₃	(CH ₃ O) ₂ C(CH ₃)
A.35	CH ₃	(CH ₃ O) ₂ CH
A.36	CH ₃	(C ₆ H ₅)-CH ₂
A.37	CH ₃	環丙基
A.38	H ₃ C-CH ₂	CH ₃
A.39	H ₃ C-CH ₂	H ₃ C-CH ₂
A.40	H ₃ C-CH ₂	H ₂ C=CH
A.41	H ₃ C-CH ₂	H ₃ C-O-CH ₂
A.42	H ₃ C-CH ₂	ClCH ₂ -CH ₂
A.43	H ₃ C-CH ₂	FCH ₂ -CH ₂
A.44	H ₃ C-CH ₂	F ₃ C-CH ₂
A.45	H ₃ C-CH ₂	Cl ₃ C-CH ₂
A.46	H ₃ C-CH ₂	HO-CH ₂ -CH ₂
A.47	H ₃ C-CH ₂	H ₃ C-O-CH ₂ -CH ₂
A.48	H ₃ C-CH ₂	(CH ₃) ₂ CH
A.49	H ₃ C-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂

	R ⁵	R ⁶
A.50	H ₃ C-CH ₂	CN-CH ₂
A.51	H ₃ C-CH ₂	CN-CH ₂ -CH ₂
A.52	H ₃ C-CH ₂	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.53	H ₃ C-CH ₂	Cl ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.54	H ₃ C-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂
A.55	H ₃ C-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)
A.56	H ₃ C-CH ₂	H ₃ C-CH(CH ₃)-CH ₂
A.57	H ₃ C-CH ₂	H ₂ C=C(CH ₃)-CH ₂
A.58	H ₃ C-CH ₂	HC≡C-CH(CH ₃)
A.59	H ₃ C-CH ₂	HC≡C-CH ₂
A.60	H ₃ C-CH ₂	(CH ₃) ₃ C
A.61	H ₃ C-CH ₂	HO
A.62	H ₃ C-CH ₂	H ₃ C-O
A.63	H ₃ C-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -O
A.64	H ₃ C-CH ₂	(CH ₃) ₂ CH-O
A.65	H ₃ C-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -O
A.66	H ₃ C-CH ₂	H ₂ C=CH-CH ₂ -O
A.67	H ₃ C-CH ₂	H ₂ C=CH-CH ₂
A.68	H ₃ C-CH ₂	HC≡C-CH ₂ -O
A.69	H ₃ C-CH ₂	(CH ₃) ₃ C-O
A.70	H ₃ C-CH ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -O
A.71	H ₃ C-CH ₂	(CH ₃ O) ₂ C(CH ₃)
A.72	H ₃ C-CH ₂	(CH ₃ O) ₂ CH
A.73	H ₃ C-CH ₂	(C ₆ H ₅)-CH ₂
A.74	H ₃ C-CH ₂	環丙基
A.75	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	CH ₃
A.76	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	H ₃ C-CH ₂
A.77	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	H ₂ C=CH
A.78	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	H ₃ C-O-CH ₂
A.79	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	ClCH ₂ -CH ₂
A.80	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	FCH ₂ -CH ₂
A.81	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	F ₃ C-CH ₂
A.82	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	Cl ₃ C-CH ₂
A.83	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	HO-CH ₂ -CH ₂
A.84	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	H ₃ C-O-CH ₂ -CH ₂
A.85	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	(CH ₃) ₂ CH
A.86	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.87	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	CN-CH ₂
A.88	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	CN-CH ₂ -CH ₂
A.89	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.90	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	Cl ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.91	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂

	R ⁵	R ⁶
A.92	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)
A.93	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	H ₃ C-CH(CH ₃)-CH ₂
A.94	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	H ₂ C=C(CH ₃)-CH ₂
A.95	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	HC≡C-CH(CH ₃)
A.96	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	HC≡C-CH ₂
A.97	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	(CH ₃) ₃ C
A.98	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	HO
A.99	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	H ₃ C-O
A.100	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -O
A.101	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	(CH ₃) ₂ CH-O
A.102	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -O
A.103	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	H ₂ C=CH-CH ₂ -O
A.104	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	H ₂ C=CH-CH ₂
A.105	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	HC≡C-CH ₂ -O
A.106	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	(CH ₃) ₃ C-O
A.107	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -O
A.108	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	(CH ₃ O) ₂ C(CH ₃)
A.109	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	(CH ₃ O) ₂ CH
A.110	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	(C ₆ H ₅)-CH ₂
A.111	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂	環丙基
A.112	(CH ₃) ₂ CH	CH ₃
A.113	(CH ₃) ₂ CH	H ₃ C-CH ₂
A.114	(CH ₃) ₂ CH	H ₂ C=CH
A.115	(CH ₃) ₂ CH	H ₃ C-O-CH ₂
A.116	(CH ₃) ₂ CH	ClCH ₂ -CH ₂
A.117	(CH ₃) ₂ CH	FCH ₂ -CH ₂
A.118	(CH ₃) ₂ CH	F ₃ C-CH ₂
A.119	(CH ₃) ₂ CH	Cl ₃ C-CH ₂
A.120	(CH ₃) ₂ CH	HO-CH ₂ -CH ₂
A.121	(CH ₃) ₂ CH	H ₃ C-O-CH ₂ -CH ₂
A.122	(CH ₃) ₂ CH	(CH ₃) ₂ CH
A.123	(CH ₃) ₂ CH	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.124	(CH ₃) ₂ CH	CN-CH ₂
A.125	(CH ₃) ₂ CH	CN-CH ₂ -CH ₂
A.126	(CH ₃) ₂ CH	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.127	(CH ₃) ₂ CH	Cl ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.128	(CH ₃) ₂ CH	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂
A.129	(CH ₃) ₂ CH	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)
A.130	(CH ₃) ₂ CH	H ₃ C-CH(CH ₃)-CH ₂
A.131	(CH ₃) ₂ CH	H ₂ C=C(CH ₃)-CH ₂
A.132	(CH ₃) ₂ CH	HC≡C-CH(CH ₃)
A.133	(CH ₃) ₂ CH	HC≡C-CH ₂

	R ⁵	R ⁶
A.134	(CH ₃) ₂ CH	(CH ₃) ₃ C
A.135	(CH ₃) ₂ CH	HO
A.136	(CH ₃) ₂ CH	H ₃ C-O
A.137	(CH ₃) ₂ CH	H ₃ C-CH ₂ -O
A.138	(CH ₃) ₂ CH	(CH ₃) ₂ CH-O
A.139	(CH ₃) ₂ CH	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -O
A.140	(CH ₃) ₂ CH	H ₂ C=CH-CH ₂ -O
A.141	(CH ₃) ₂ CH	H ₂ C=CH-CH ₂
A.142	(CH ₃) ₂ CH	HC≡C-CH ₂ -O
A.143	(CH ₃) ₂ CH	(CH ₃) ₃ C-O
A.144	(CH ₃) ₂ CH	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -O
A.145	(CH ₃) ₂ CH	(CH ₃ O) ₂ C(CH ₃)
A.146	(CH ₃) ₂ CH	(CH ₃ O) ₂ CH
A.147	(CH ₃) ₂ CH	(C ₆ H ₅)-CH ₂
A.148	(CH ₃) ₂ CH	環丙基
A.149	CNCH ₂	CH ₃
A.150	CNCH ₂	H ₃ C-CH ₂
A.151	CNCH ₂	H ₂ C=CH
A.152	CNCH ₂	H ₃ C-O-CH ₂
A.153	CNCH ₂	ClCH ₂ -CH ₂
A.154	CNCH ₂	FCH ₂ -CH ₂
A.155	CNCH ₂	F ₃ C-CH ₂
A.156	CNCH ₂	Cl ₃ C-CH ₂
A.157	CNCH ₂	HO-CH ₂ -CH ₂
A.158	CNCH ₂	H ₃ C-O-CH ₂ -CH ₂
A.159	CNCH ₂	(CH ₃) ₂ CH
A.160	CNCH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.161	CNCH ₂	CN-CH ₂
A.162	CNCH ₂	CN-CH ₂ -CH ₂
A.163	CNCH ₂	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.164	CNCH ₂	Cl ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.165	CNCH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂
A.166	CNCH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)
A.167	CNCH ₂	H ₃ C-CH(CH ₃)-CH ₂
A.168	CNCH ₂	H ₂ C=C(CH ₃)-CH ₂
A.169	CNCH ₂	HC≡C-CH(CH ₃)
A.170	CNCH ₂	HC≡C-CH ₂
A.171	CNCH ₂	(CH ₃) ₃ C
A.172	CNCH ₂	HO
A.173	CNCH ₂	H ₃ C-O
A.174	CNCH ₂	H ₃ C-CH ₂ -O
A.175	CNCH ₂	(CH ₃) ₂ CH-O

	R^5	R^6
A.176	CNCH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -O
A.177	CNCH ₂	H ₂ C=CH-CH ₂ -O
A.178	CNCH ₂	H ₂ C=CH-CH ₂
A.179	CNCH ₂	HC≡C-CH ₂ -O
A.180	CNCH ₂	(CH ₃) ₃ C-O
A.181	CNCH ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -O
A.182	CNCH ₂	(CH ₃ O) ₂ C(CH ₃)
A.183	CNCH ₂	(CH ₃ O) ₂ CH
A.184	CNCH ₂	(C ₆ H ₅)-CH ₂
A.185	CNCH ₂	環丙基
A.186	F ₃ C-CH ₂	CH ₃
A.187	F ₃ C-CH ₂	H ₃ C-CH ₂
A.188	F ₃ C-CH ₂	H ₂ C=CH
A.189	F ₃ C-CH ₂	H ₃ C-O-CH ₂
A.190	F ₃ C-CH ₂	ClCH ₂ -CH ₂
A.191	F ₃ C-CH ₂	FCH ₂ -CH ₂
A.192	F ₃ C-CH ₂	F ₃ C-CH ₂
A.193	F ₃ C-CH ₂	Cl ₃ C-CH ₂
A.194	F ₃ C-CH ₂	HO-CH ₂ -CH ₂
A.195	F ₃ C-CH ₂	H ₃ C-O-CH ₂ -CH ₂
A.196	F ₃ C-CH ₂	(CH ₃) ₂ CH
A.197	F ₃ C-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.198	F ₃ C-CH ₂	CN-CH ₂
A.199	F ₃ C-CH ₂	CN-CH ₂ -CH ₂
A.200	F ₃ C-CH ₂	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.201	F ₃ C-CH ₂	Cl ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.202	F ₃ C-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂
A.203	F ₃ C-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)
A.204	F ₃ C-CH ₂	H ₃ C-CH(CH ₃)-CH ₂
A.205	F ₃ C-CH ₂	H ₂ C=C(CH ₃)-CH ₂
A.206	F ₃ C-CH ₂	HC≡C-CH(CH ₃)
A.207	F ₃ C-CH ₂	HC≡C-CH ₂
A.208	F ₃ C-CH ₂	(CH ₃) ₃ C
A.209	F ₃ C-CH ₂	HO
A.210	F ₃ C-CH ₂	H ₃ C-O
A.211	F ₃ C-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -O
A.212	F ₃ C-CH ₂	(CH ₃) ₂ CH-O
A.213	F ₃ C-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -O
A.214	F ₃ C-CH ₂	H ₂ C=CH-CH ₂ -O
A.215	F ₃ C-CH ₂	H ₂ C=CH-CH ₂
A.216	F ₃ C-CH ₂	HC≡C-CH ₂ -O
A.217	F ₃ C-CH ₂	(CH ₃) ₃ C-O

	R ⁵	R ⁶
A.218	F ₃ C-CH ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -O
A.219	F ₃ C-CH ₂	(CH ₃ O) ₂ C(CH ₃)
A.220	F ₃ C-CH ₂	(CH ₃ O) ₂ CH
A.221	F ₃ C-CH ₂	(C ₆ H ₅)-CH ₂
A.222	F ₃ C-CH ₂	環丙基
A.223	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	CH ₃
A.224	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	H ₃ C-CH ₂
A.225	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	H ₂ C=CH
A.226	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	H ₃ C-O-CH ₂
A.227	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	ClCH ₂ -CH ₂
A.228	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	FCH ₂ -CH ₂
A.229	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	F ₃ C-CH ₂
A.230	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	Cl ₃ C-CH ₂
A.231	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	HO-CH ₂ -CH ₂
A.232	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	H ₃ C-O-CH ₂ -CH ₂
A.233	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	(CH ₃) ₂ CH
A.234	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.235	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	CN-CH ₂
A.236	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	CN-CH ₂ -CH ₂
A.237	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.238	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	Cl ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.239	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂
A.240	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)
A.241	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	H ₃ C-CH(CH ₃)-CH ₂
A.242	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	H ₂ C=C(CH ₃)-CH ₂
A.243	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	HC≡C-CH(CH ₃)
A.244	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	HC≡C-CH ₂
A.245	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	(CH ₃) ₃ C
A.246	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	HO
A.247	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	H ₃ C-O
A.248	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	H ₃ C-CH ₂ -O
A.249	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	(CH ₃) ₂ CH-O
A.250	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -O
A.251	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	H ₂ C=CH-CH ₂ -O
A.252	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	H ₂ C=CH-CH ₂
A.253	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	HC≡C-CH ₂ -O
A.254	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	(CH ₃) ₃ C-O
A.255	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -O
A.256	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	(CH ₃ O) ₂ C(CH ₃)
A.257	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	(CH ₃ O) ₂ CH
A.258	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	(C ₆ H ₅)-CH ₂

	R ⁵	R ⁶
A.259	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)	環丙基
A.260	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	CH ₃
A.261	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	H ₃ C-CH ₂
A.262	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	H ₂ C=CH
A.263	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	H ₃ C-O-CH ₂
A.264	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	ClCH ₂ -CH ₂
A.265	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	FCH ₂ -CH ₂
A.266	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	F ₃ C-CH ₂
A.267	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	Cl ₃ C-CH ₂
A.268	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	HO-CH ₂ -CH ₂
A.269	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	H ₃ C-O-CH ₂ -CH ₂
A.270	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	(CH ₃) ₂ CH
A.271	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.272	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	CN-CH ₂
A.273	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	CN-CH ₂ -CH ₂
A.274	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.275	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	Cl ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.276	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂
A.277	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)
A.278	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	H ₃ C-CH(CH ₃)-CH ₂
A.279	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	H ₂ C=C(CH ₃)-CH ₂
A.280	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	HC≡C-CH(CH ₃)
A.281	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	HC≡C-CH ₂
A.282	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	(CH ₃) ₃ C
A.283	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	HO
A.284	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	H ₃ C-O
A.285	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -O
A.286	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	(CH ₃) ₂ CH-O
A.287	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -O
A.288	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	H ₂ C=CH-CH ₂ -O
A.289	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	H ₂ C=CH-CH ₂
A.290	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	HC≡C-CH ₂ -O
A.291	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	(CH ₃) ₃ C-O
A.292	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -O
A.293	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	(CH ₃ O) ₂ C(CH ₃)
A.294	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	(CH ₃ O) ₂ CH
A.295	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	(C ₆ H ₅)-CH ₂
A.296	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	環丙基
A.297	H ₂ C=CH-CH ₂	CH ₃
A.298	H ₂ C=CH-CH ₂	H ₃ C-CH ₂
A.299	H ₂ C=CH-CH ₂	H ₂ C=CH

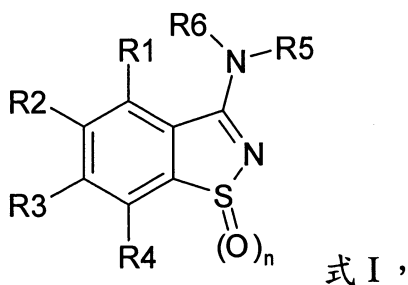
	R ⁵	R ⁶
A.300	H ₂ C=CH-CH ₂	H ₃ C-O-CH ₂
A.301	H ₂ C=CH-CH ₂	ClCH ₂ -CH ₂
A.302	H ₂ C=CH-CH ₂	FCH ₂ -CH ₂
A.303	H ₂ C=CH-CH ₂	F ₃ C-CH ₂
A.304	H ₂ C=CH-CH ₂	Cl ₃ C-CH ₂
A.305	H ₂ C=CH-CH ₂	HO-CH ₂ -CH ₂
A.306	H ₂ C=CH-CH ₂	H ₃ C-O-CH ₂ -CH ₂
A.307	H ₂ C=CH-CH ₂	(CH ₃) ₂ CH
A.308	H ₂ C=CH-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.309	H ₂ C=CH-CH ₂	CN-CH ₂
A.310	H ₂ C=CH-CH ₂	CN-CH ₂ -CH ₂
A.311	H ₂ C=CH-CH ₂	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.312	H ₂ C=CH-CH ₂	Cl ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.313	H ₂ C=CH-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂
A.314	H ₂ C=CH-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)
A.315	H ₂ C=CH-CH ₂	H ₃ C-CH(CH ₃)-CH ₂
A.316	H ₂ C=CH-CH ₂	H ₂ C=C(CH ₃)-CH ₂
A.317	H ₂ C=CH-CH ₂	HC≡C-CH(CH ₃)
A.318	H ₂ C=CH-CH ₂	HC≡C-CH ₂
A.319	H ₂ C=CH-CH ₂	(CH ₃) ₃ C
A.320	H ₂ C=CH-CH ₂	HO
A.321	H ₂ C=CH-CH ₂	H ₃ C-O
A.322	H ₂ C=CH-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -O
A.323	H ₂ C=CH-CH ₂	(CH ₃) ₂ CH-O
A.324	H ₂ C=CH-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -O
A.325	H ₂ C=CH-CH ₂	H ₂ C=CH-CH ₂ -O
A.326	H ₂ C=CH-CH ₂	H ₂ C=CH-CH ₂
A.327	H ₂ C=CH-CH ₂	HC≡C-CH ₂ -O
A.328	H ₂ C=CH-CH ₂	(CH ₃) ₃ C-O
A.329	H ₂ C=CH-CH ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -O
A.330	H ₂ C=CH-CH ₂	(CH ₃ O) ₂ C(CH ₃)
A.331	H ₂ C=CH-CH ₂	(CH ₃ O) ₂ CH
A.332	H ₂ C=CH-CH ₂	(C ₆ H ₅)-CH ₂
A.333	H ₂ C=CH-CH ₂	環丙基
A.334	HC≡C-CH ₂	CH ₃
A.335	HC≡C-CH ₂	H ₃ C-CH ₂
A.336	HC≡C-CH ₂	H ₂ C=CH
A.337	HC≡C-CH ₂	H ₃ C-O-CH ₂
A.338	HC≡C-CH ₂	ClCH ₂ -CH ₂
A.339	HC≡C-CH ₂	FCH ₂ -CH ₂
A.340	HC≡C-CH ₂	F ₃ C-CH ₂
A.341	HC≡C-CH ₂	Cl ₃ C-CH ₂

	R ⁵	R ⁶
A.342	HC≡C-CH ₂	HO-CH ₂ -CH ₂
A.343	HC≡C-CH ₂	H ₃ C-O-CH ₂ -CH ₂
A.344	HC≡C-CH ₂	(CH ₃) ₂ CH
A.345	HC≡C-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.346	HC≡C-CH ₂	CN-CH ₂
A.347	HC≡C-CH ₂	CN-CH ₂ -CH ₂
A.348	HC≡C-CH ₂	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.349	HC≡C-CH ₂	Cl ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.350	HC≡C-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂
A.351	HC≡C-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)
A.352	HC≡C-CH ₂	H ₃ C-CH(CH ₃)-CH ₂
A.353	HC≡C-CH ₂	H ₂ C=C(CH ₃)-CH ₂
A.354	HC≡C-CH ₂	HC≡C-CH(CH ₃)
A.355	HC≡C-CH ₂	HC≡C-CH ₂
A.356	HC≡C-CH ₂	(CH ₃) ₃ C
A.357	HC≡C-CH ₂	HO
A.358	HC≡C-CH ₂	H ₃ C-O
A.359	HC≡C-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -O
A.360	HC≡C-CH ₂	(CH ₃) ₂ CH-O
A.361	HC≡C-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -O
A.362	HC≡C-CH ₂	H ₂ C=CH-CH ₂ -O
A.363	HC≡C-CH ₂	H ₂ C=CH-CH ₂
A.364	HC≡C-CH ₂	HC≡C-CH ₂ -O
A.365	HC≡C-CH ₂	(CH ₃) ₃ C-O
A.366	HC≡C-CH ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -O
A.367	HC≡C-CH ₂	(CH ₃ O) ₂ C(CH ₃)
A.368	HC≡C-CH ₂	(CH ₃ O) ₂ CH
A.369	HC≡C-CH ₂	(C ₆ H ₅)-CH ₂
A.370	HC≡C-CH ₂	環丙基
A.371	環丙基	CH ₃
A.372	環丙基	H ₃ C-CH ₂
A.373	環丙基	H ₂ C=CH
A.374	環丙基	H ₃ C-O-CH ₂
A.375	環丙基	ClCH ₂ -CH ₂
A.376	環丙基	FCH ₂ -CH ₂
A.377	環丙基	F ₃ C-CH ₂
A.378	環丙基	Cl ₃ C-CH ₂
A.379	環丙基	HO-CH ₂ -CH ₂
A.380	環丙基	H ₃ C-O-CH ₂ -CH ₂
A.381	環丙基	(CH ₃) ₂ CH

	R ⁵	R ⁶
A.382	環丙基	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.383	環丙基	CN-CH ₂
A.384	環丙基	CN-CH ₂ -CH ₂
A.385	環丙基	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.386	環丙基	Cl ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.387	環丙基	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂
A.388	環丙基	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)
A.389	環丙基	H ₃ C-CH(CH ₃)-CH ₂
A.390	環丙基	H ₂ C=C(CH ₃)-CH ₂
A.391	環丙基	HC≡C-CH(CH ₃)
A.392	環丙基	HC≡C-CH ₂
A.393	環丙基	(CH ₃) ₃ C
A.394	環丙基	HO
A.395	環丙基	H ₃ C-O
A.396	環丙基	H ₃ C-CH ₂ -O
A.397	環丙基	(CH ₃) ₂ CH-O
A.398	環丙基	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -O
A.399	環丙基	H ₂ C=CH-CH ₂ -O
A.400	環丙基	H ₂ C=CH-CH ₂
A.401	環丙基	HC≡C-CH ₂ -O
A.402	環丙基	(CH ₃) ₃ C-O
A.403	環丙基	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -O
A.404	環丙基	(CH ₃ O) ₂ C(CH ₃)
A.405	環丙基	(CH ₃ O) ₂ CH
A.406	環丙基	(C ₆ H ₅)-CH ₂
A.407	環丙基	環丙基
A.408	(C ₆ H ₅)-CH ₂	CH ₃
A.409	(C ₆ H ₅)-CH ₂	H ₃ C-CH ₂
A.410	(C ₆ H ₅)-CH ₂	H ₂ C=CH
A.411	(C ₆ H ₅)-CH ₂	H ₃ C-O-CH ₂
A.412	(C ₆ H ₅)-CH ₂	ClCH ₂ -CH ₂
A.413	(C ₆ H ₅)-CH ₂	FCH ₂ -CH ₂
A.414	(C ₆ H ₅)-CH ₂	F ₃ C-CH ₂
A.415	(C ₆ H ₅)-CH ₂	Cl ₃ C-CH ₂
A.416	(C ₆ H ₅)-CH ₂	HO-CH ₂ -CH ₂
A.417	(C ₆ H ₅)-CH ₂	H ₃ C-O-CH ₂ -CH ₂
A.418	(C ₆ H ₅)-CH ₂	(CH ₃) ₂ CH
A.419	(C ₆ H ₅)-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂

	R ⁵	R ⁶
A.420	(C ₆ H ₅)-CH ₂	CN-CH ₂
A.421	(C ₆ H ₅)-CH ₂	CN-CH ₂ -CH ₂
A.422	(C ₆ H ₅)-CH ₂	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.423	(C ₆ H ₅)-CH ₂	Cl ₃ C-CH ₂ -CH ₂
A.424	(C ₆ H ₅)-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂
A.425	(C ₆ H ₅)-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH(CH ₃)
A.426	(C ₆ H ₅)-CH ₂	H ₃ C-CH(CH ₃)-CH ₂
A.427	(C ₆ H ₅)-CH ₂	H ₂ C=C(CH ₃)-CH ₂
A.428	(C ₆ H ₅)-CH ₂	HC≡C-CH(CH ₃)
A.429	(C ₆ H ₅)-CH ₂	HC≡C-CH ₂
A.430	(C ₆ H ₅)-CH ₂	(CH ₃) ₃ C
A.431	(C ₆ H ₅)-CH ₂	HO
A.432	(C ₆ H ₅)-CH ₂	H ₃ C-O
A.433	(C ₆ H ₅)-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -O
A.434	(C ₆ H ₅)-CH ₂	(CH ₃) ₂ CH-O
A.435	(C ₆ H ₅)-CH ₂	H ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -O
A.436	(C ₆ H ₅)-CH ₂	H ₂ C=CH-CH ₂ -O
A.437	(C ₆ H ₅)-CH ₂	H ₂ C=CH-CH ₂
A.438	(C ₆ H ₅)-CH ₂	HC≡C-CH ₂ -O
A.439	(C ₆ H ₅)-CH ₂	(CH ₃) ₃ C-O
A.440	(C ₆ H ₅)-CH ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -O
A.441	(C ₆ H ₅)-CH ₂	(CH ₃ O) ₂ C(CH ₃)
A.442	(C ₆ H ₅)-CH ₂	(CH ₃ O) ₂ CH
A.443	(C ₆ H ₅)-CH ₂	(C ₆ H ₅)-CH ₂
A.444	(C ₆ H ₅)-CH ₂	環丙基

本發明亦係關於以下式I之新穎3-胺基-1,2-苯并異噻唑
化合物



其中

n 為 0、1 或 2；

R¹ 為硝基、氟基、疊氮基、胺基、鹵素、磺醯胺基、次

磺醯胺基、亞磺醯胺基、 $C(=O)R^{1a}$ 、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_8 環烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_1-C_6 烷基硫基、 $(C_1-C_6$ 烷基)胺基、二 $(C_1-C_6$ 烷基)胺基、 C_1-C_6 烷基亞磺醯基或 C_1-C_6 烷基磺醯基，其中最後提及之十一個基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由下列基團組成之群的基團：氰基、硝基、胺基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基硫基、 C_1-C_4 烷基亞磺醯基、 C_1-C_4 烷基磺醯基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷基硫基、 $(C_1-C_4$ 烷氧基)羰基、 $(C_1-C_4$ 烷基)胺基、二 $(C_1-C_4$ 烷基)胺基、 C_3-C_8 環烷基及苯基，苯基可能未經取代、經部分或完全鹵化及/或帶有1、2或3個彼此獨立地選自由下列基團組成之群的取代基： C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_1-C_4 烷氧基及 C_1-C_4 鹵烷氧基，且其中

R^{1a} 係選自由下列基團組成之群：氫、羥基、 C_1-C_6 烷氧基、胺基、 $(C_1-C_6$ 烷基)胺基、二 $(C_1-C_6$ 烷基)胺基、 C_1-C_6 烷基、芳基、芳基- C_1-C_6 烷基、3至7員雜芳基或雜芳基- C_1-C_6 烷基，其中雜芳基環含有作為環成員之1、2或3個選自由下列組成之群的雜原子：氮、氧、硫、基團SO、 SO_2 及 $N-R^n$ ，其中 R^n 為氫、 C_1-C_6 烷基或 $(C_1-C_6$ 烷基-)羰基；

R^2 、 R^3 及 R^4 係彼此獨立地選自由下列基團組成之群：氫、鹵素、氰基、疊氮基、硝基、 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_8 環烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基硫基、 C_1-

C₄烷基亞磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄鹵烷硫基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、(C₁-C₄烷氧基)羰基、胺基、(C₁-C₄烷基)胺基、二(C₁-C₄烷基)胺基、胺基羰基、(C₁-C₄烷基)胺基羰基、二(C₁-C₄烷基)胺基羰基、磺醯基、磺醯胺基、次磺醯胺基、硫基胺基及C(=O)-R^{2a}或C(=O)-R^{3a}或C(=O)-R^{4a}，且其中R^{2a}或R^{3a}或R^{4a}係選自由下列基團組成之群：氫、羥基、C₁-C₆烷氧基、胺基、C₁-C₆烷基、芳基、芳基-C₁-C₆烷基、(C₁-C₆烷基)-胺基、二-(C₁-C₆烷基)-胺基、3至7員雜芳基或雜芳基-C₁-C₄烷基，其中雜芳基環含有作為環成員之1、2或3個選自由下列組成之群的雜原子：氮、氧、硫、基團SO、SO₂及N-Rⁿ，其中Rⁿ為氫、C₁-C₆烷基或(C₁-C₆烷基)-羰基；

R⁵ 係選自由下列基團組成之群：OR^{5a}、C₁-C₁₀烷基、C₂-C₁₀烯基、C₂-C₁₀炔基、C₃-C₁₀環烷基，其中，最後提及之四個基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1-4個選自由下列基團組成之群的基團：C₁-C₁₀烷氧基、C₁-C₁₀烷硫基、C₁-C₁₀烷基亞磺醯基、C₁-C₁₀烷基磺醯基、C₁-C₁₀鹵烷氧基、C₁-C₁₀鹵烷硫基、(C₁-C₁₀烷氧基-)羰基、氰基、硝基、胺基、(C₁-C₁₀烷基)胺基、二-(C₁-C₁₀烷基)胺基、C₃-C₁₀環烷基及苯基，苯基可能未經取代、經部分或完全鹵化及/或帶有選自由下列基團組成之群的取代基：C₁-C₆烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₁-C₆烷氧基及C₁-C₆鹵烷氧基，且其中

R^{5a} 係選自氫、 C_1 - C_{10} 烷基、 C_1 - C_{10} 鹼基、 C_3 - C_{10} 環烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_2 - C_{10} 炔基、芳基、芳基- C_1 - C_4 烷基、雜芳基及雜芳基- C_1 - C_4 烷基、雜環基或雜環基- C_1 - C_4 烷基，且其中該等基團之碳原子可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由下列基團組成之群的基團：氰基、硝基、胺基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺基、 C_1 - C_4 烷基磺基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、(C_1 - C_4 烷氧基)羰基、(C_1 - C_4 烷基)胺基、二(C_1 - C_4 烷基)胺基及 C_3 - C_8 環烷基；

R^6 係選自由下列基團組成之群： C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_2 - C_{10} 炔基、 C_3 - C_{10} 環烷基，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1-4個選自由下列基團之群的基團： C_1 - C_{10} 烷氧基、 C_1 - C_{10} 烷硫基、 C_1 - C_{10} 烷基亞磺基、 C_1 - C_{10} 烷基磺基、 C_1 - C_{10} 鹵烷氧基、 C_1 - C_{10} 鹵烷硫基、(C_1 - C_{10} 烷氧基-)羰基、氰基、硝基、胺基、(C_1 - C_{10} 烷基)胺基、二-(C_1 - C_{10} 烷基)胺基、 C_3 - C_{10} 環烷基及苯基，苯基可能未經取代、經部分或完全鹵化及/或帶有選自由下列基團組成之群的取代基： C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_1 - C_6 烷氧基或 C_1 - C_6 鹵烷氧基；

且其中式I化合物並不表示4-氯-3-N,N-胺基-二甲基-1,2-苯并異噻唑。

較佳為式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之

組合物，其中 n 為 2。

亦較佳為式 I 之 3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之組合物，其中 n 為 0。

尤其較佳為式 I 之 3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之組合物，其中

R^1 為鹵素、 $C(=O)R^{1a}$ 、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_8 環烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有 1、2 或 3 個選自由下列基團組成之群的基團： C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、(C_1 - C_4 烷氧基)羰基及 C_3 - C_8 環烷基，且其中

R^{1a} 係選自由下列基團組成之群：氫、羥基、 C_1 - C_6 烷氧基、胺基、(C_1 - C_6 烷基)胺基、二(C_1 - C_6 烷基)胺基、 C_1 - C_6 烷基、芳基、芳基- C_1 - C_4 烷基。

尤其較佳為彼等式 I 之 3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之組合物，其中

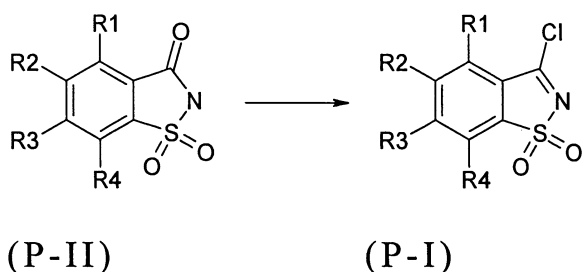
R^1 為鹵素、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有 1、2 或 3 個選自由 C_1 - C_4 烷氧基及 C_1 - C_4 鹵烷氧基組成之群的基團。

本發明之 3-胺基-1,2-苯并異噻唑衍生物可藉由不同製備方法使用不同前驅體來製備。

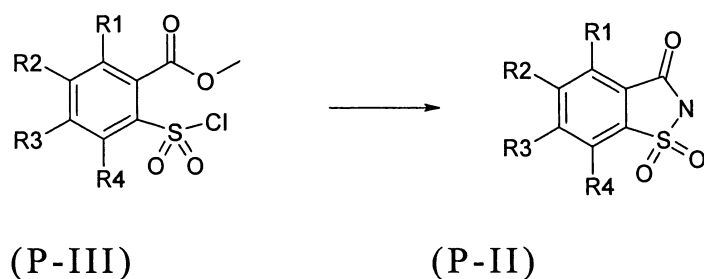
P.1. 氯-苯并異噻唑

如由 D. Dopp 等人於 Synthesis 2001, 8, 1228-1235 中，由 R. Salman 於 Chem. Eng. Data 1987, 32, 391 中或由 R. W. Lang 於 Helvetica Chimica Acta 1989, 72, 1248-1252 中所

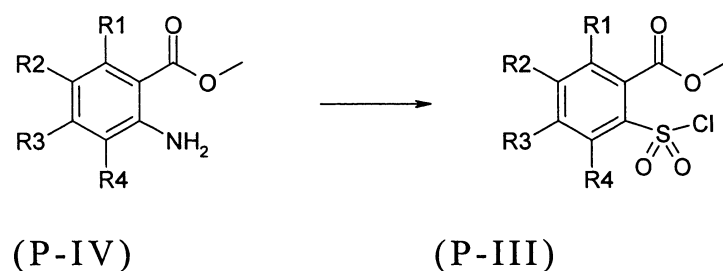
述，3-氯-苯并[d]異噻唑1,1-二氧化物(P-I)可藉由使經適當取代之糖精(P-II)與諸如 $\text{ClCO}_2\text{CCl}_3$ 、 $\text{PCl}_5/\text{POCl}_3$ 或 SOCl_2 之氯化劑反應來製備。



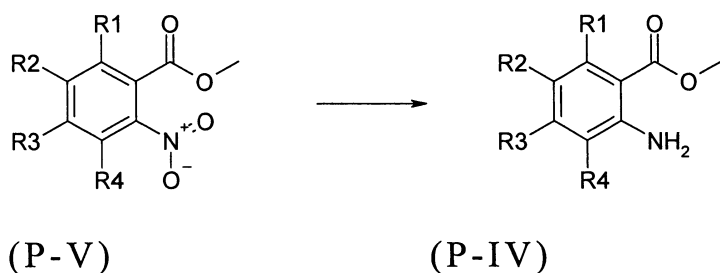
如由 M. C. Bell 等人於 *Bioorganic & Medicinal Letters* 1991, 第 12 期, 733-736 中或 M. L. Trudell 等人於 *Journal of Heterocyclic Chem.* 2004, 41, 435 中所述, 經取代之糖精 (P-II) 可經由 2-氯磺醯基-苯甲酸酯 (P-III) 與氨之反應來製備。



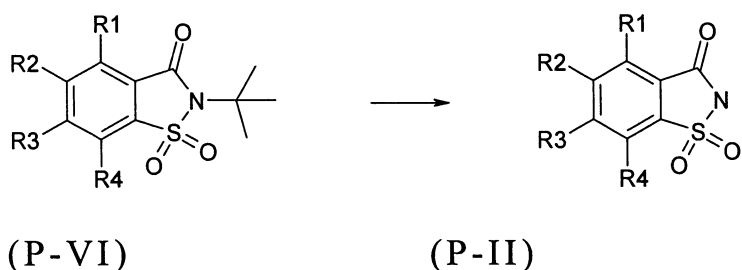
後一篇文章亦描述自相應之鄰氨基苯甲酸甲酯 (P-IV) 經由重氮化及隨後之氯磺酸化合成所提及之 2-氯磺醯基-苯甲酸酯 (P-III)。G. Hamprecht 等人於 *Chimia* (2004), 58 117-122 中描述類似之合成程序。



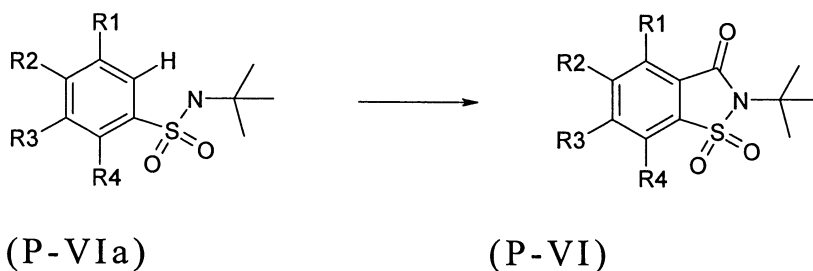
在鄰胺基苯甲酸甲酯不可購得之情況下，如 J. F. W. Keana 等人於 *Bioorganic & Medicinal Chemistry* 11 (2003) 1769-1780 中所述，其可自相應之 2-硝基苯甲酸甲酯 (P-V) 經由催化氫化來製備。



或者，糖精 (P-II) 可以 K. F. Burri 於 *Helvetica Chimica Acta* 1990, 73, 69-80 中所述之方式藉由經由與諸如三氟乙酸之強酸一起加熱而裂解相應之 N-第三丁基糖精 (P-VI) 來製備。

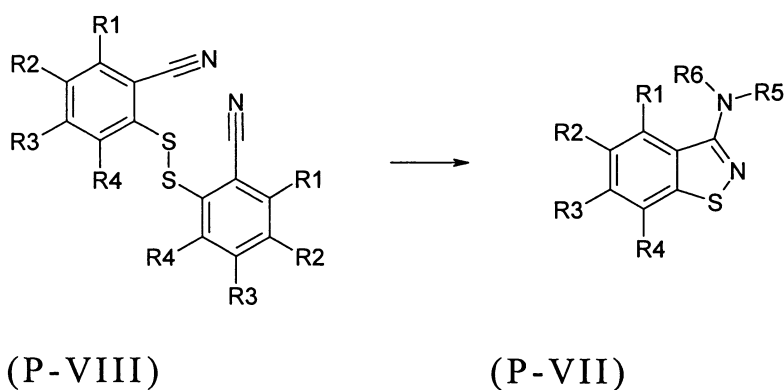


N-第三丁基糖精 (P-VI) 可自相應之磺醯胺 (P-VIa) 藉由用諸如丁基鋰或二異丙基醯胺鋰之鹼直接鄰位金屬化且隨後在閉環作用下用二氧化碳捕獲金屬化合物來獲得。D. Becker 等人於 *Tetrahedron* 1992, 2515-2522 中描述了該程序。金屬化可如 N. Murugesan 等人於 *J. Med. Chem.* 1998, 41, 5198-5218 中所述來進行。

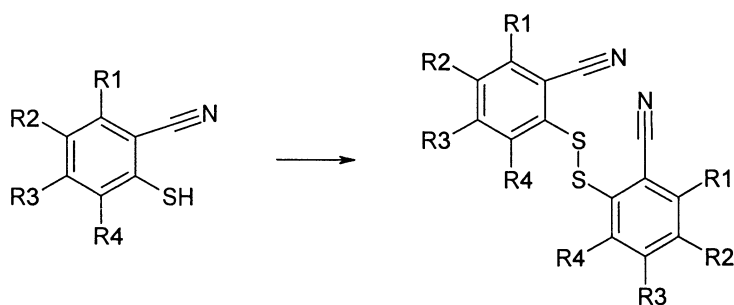


P.2. 胺基苯并異噻唑：

如 S. W. Walinsky 等人於 *Organic Process Research & Development* 1999, 3, 126-130 中所述，胺基苯并異噻唑 (P-VII) 可藉由將經適當取代之二硫化物 (P-VIII) 連同胺及諸如二甲亞砜 (DMSO) 之氧化劑於諸如異丙醇之極性溶劑中加熱來製備。或者，如 T. Nakamura 等人於 *Synthesis* 1997, 871-873 中所述，可藉由使用與格林納試劑 (Grignard reagent) (諸如氯化正丙基鎂) 及作為氧化劑之銅 (II) 鹽組合之該等胺於諸如四氫呋喃 (THF) 之溶劑中進行加成。



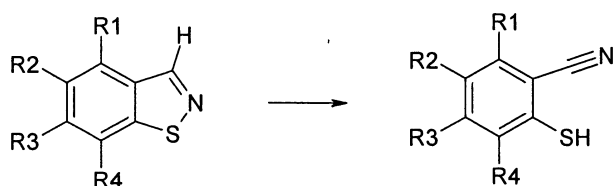
如 H. Boerzel 等人於 *Inorganic Chemistry* 2003, 1604-1615 中所報導，2-氰基-二硫化物 (P-VIII) 可自相應之硫酚 (P-IX) 藉由使用諸如二甲亞砜 (DMSO) 之氧化劑來製備。



(P-IX)

(P-VIII)

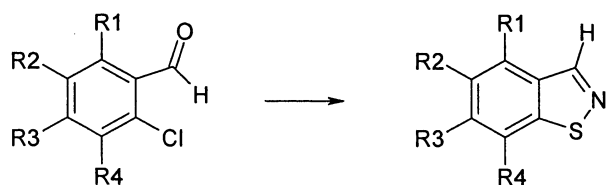
如 J. Markert 等人於 Liebigs Annalen d. Chemie 1980, 768-778 中所述，2-氰基-硫酚 (P-IX) 可自苯并異噻唑 (P-X) 藉由用諸如 NaOCH_3 之強鹼處理來製備。



(P-X)

(P-IX)

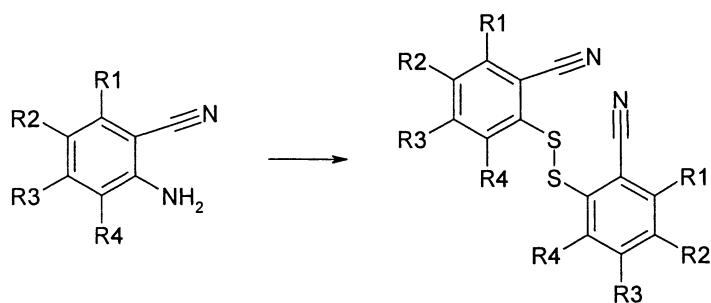
該文章亦描述自 2-氯-苯甲醛 (P-XI) 經由與硫及氮之反應合成經取代之苯并異噻唑 (P-X)。



(P-XI)

(P-X)

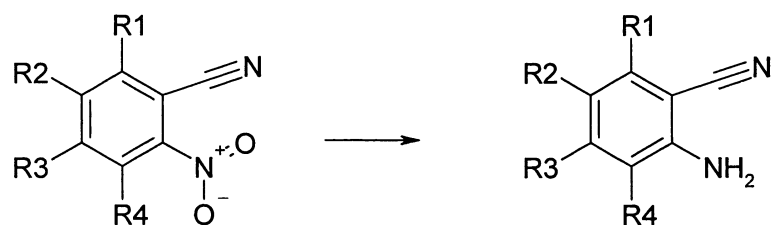
或者如 V. M. Negrimovsky 等人於 Phosphorus, Sulfur & The Related Elements 1995, 104, 161-167 中所述，2-氰基-二硫化物 (P-VIII) 可自 2-氰基-苯胺 (P-XII) 經由重氮化且隨後用 Na_2S 及硫中止重氮鹽來製備。



(P-XII)

(P-VIII)

如 D. H. Klaubert 於 J. Med. Chem. 1981, 24, 742-748 中所述，2-氰基-苯胺 (P-XII) 可用諸如鐵之還原劑自 2-氰基-硝基苯 (P-XIII) 來製備。

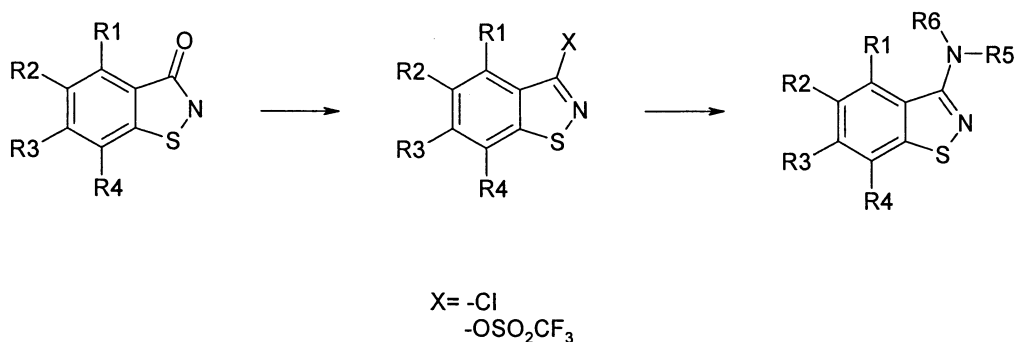


(P-XIII)

(P-XII)

3-氨基-1,2-苯并異噻唑 (P-VII) 亦可自 3-氯-苯并[d]異噻唑 (P-XIIIa) (如 H. Boeshagen 等人於 Justus Liebig Annalen der Chemie, 1977, 20 中所述)，或自三氯-甲烷磺酸苯并[d]異噻唑-3-基酯 (P-XIIIb) (類似於 US 5359068) 藉由使該等化合物與胺反應來製備。

3-氯-苯并[d]異噻唑 (P-XIIIa) 可自苯并異噻唑酮 (P-XIV) 藉由與諸如 PCl_3 (J.P. Yevich 等人於 Journal of Medicinal Chemistry 1986, 29, 359-369 中所述) 或 $\text{PCl}_3/\text{PCl}_5$ (S. G. Zlutin 等人，Journal of Organic Chemistry 2000, 65, 8439-8443) 之氯化劑的反應來獲得。

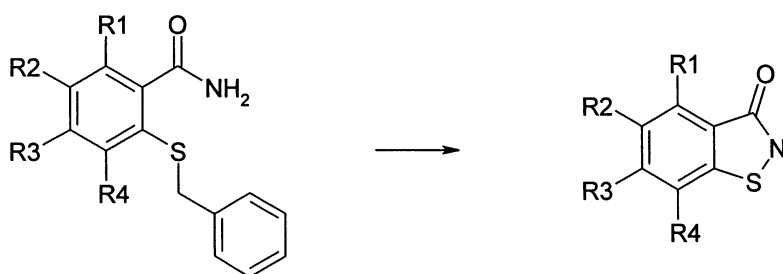


(P-XIV)

(P-XIIIa/XIIIb)

(P-VII)

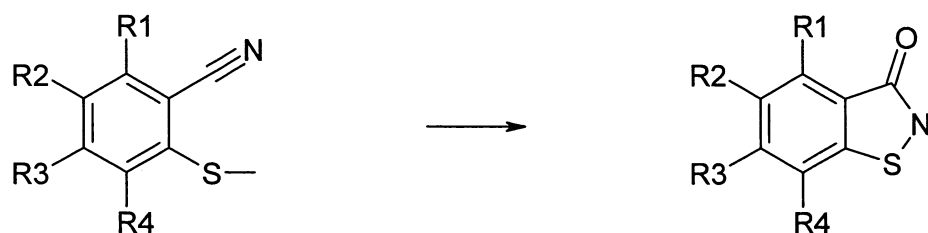
最後提及之參考文獻亦描述自化合物(P-XV)經由用諸如 SO_2Cl_2 之氧化劑處理來合成該苯并異噻唑酮。



(P-XV)

(P-XIV)

或者EP 1081141中描述自2-(烷硫基)-苯甲腈(P-XVI)以單釜程序製備苯并異噻唑酮(P-XVI)之另一種方法。



(P-XVI)

(P-XIV)

以常規之方式(例如藉由與水混合、相分離及(若適當)層析純化粗產物)來處理反應混合物。在一些情況下，獲得為無色或淡褐色黏性油狀之中間物及終產物，其於減壓下及適度高溫下純化或除去揮發性組份。若獲得呈固態之中

間物及終產物，則其亦可藉由再結晶或蒸煮來純化。

若個別化合物I不可藉由上述路線獲得，則其可藉由其他化合物I之衍生作用或藉由所述合成路線之常規修改方案來製備。

製備式I之化合物會使得其作為異構物混合物而獲得。若需要，則該等問題可藉由通常用於達到此目的之方法(諸如結晶或層析，亦於光活性吸附物上)來解決以得到純異構物。

可以常規方式，例如藉由與所述之陰離子之酸反應來形成化合物I之農藝學上可接受的鹽。

害蟲

式I之化合物適合在作物保護中有效控制線蟲、昆蟲及蛛形蟲。詳言之，其適合於控制下列動物害蟲：

鱗翅目之昆蟲(鱗翅目)，例如小地老虎(*Agrotis ypsilon*)、黃地老虎(*Agrotis segetum*)、棉葉波紋葉蛾(*Alabama argillacea*)、黎豆夜蛾(*Anticarsia gemmatalis*)、蘋實巢蛾(*Argyresthia conjugella*)、丫紋夜蛾(*Autographa gamma*)、松樹尺蠖(*Bupalus piniarius*)、卷葉蛾(*Cacoecia murinana*)、棉褐帶卷蛾(*Capua reticulana*)、冬尺蠖(*Cheimatobia brumata*)、雲杉卷葉蛾(*Choristoneura fumiferana*)、苜蓿卷葉蛾(*Choristoneura occidentalis*)、苜蓿黏蟲(*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*)、小卷蛾 (*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*)、落葉松尺蛾 (*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*)、細蛾 (*Lithocolletis blancardella*)、葡萄漿果小卷蛾 (*Lobesia botrana*)、黃綠條螟 (*Loxostege sticticalis*)、舞毒蛾 (*Lymantria dispar*)、僧尼毒蛾 (*Lymantria monacha*)、窄翅潛葉蛾 (*Lyonetia clerkella*)、天幕毛蟲 (*Malacosoma neustria*)、甘藍夜蛾 (*Mamestra brassicae*)、花旗松毒蛾 (*Orgyia pseudotsugata*)、歐洲玉米螟 (*Ostrinia nubilalis*)、冬夜蛾 (*Panolis flammea*)、紅鈴蟲 (*Pectinophora gossypiella*)、雜色地老虎 (*Peridroma saucia*)、圓掌舟蛾 (*Phalera bucephala*)、馬鈴薯塊莖蛾 (*Phthorimaea operculella*)、橘細潛蛾 (*Phyllocnistis citrella*)、大菜粉蝶 (*Pieris brassicae*)、苜蓿綠夜蛾 (*Plathypena scabra*)、小菜蛾 (*Plutella xylostella*)、大豆夜蛾 (*Pseudoplusia*

includens)、松梢卷葉蛾(*Rhyacionia frustrana*)、馬鈴薯潛葉蟲(*Scrobipalpula absoluta*)、麥蛾(*Sitotoga cerealella*)、葡萄長須卷葉蛾(*Sparganothis pilleriana*)、草地黏蟲(*Spodoptera frugiperda*)、灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis*)、斜紋夜蛾(*Spodoptera litura*)、松異帶蛾(*Thaumtopoea pityocampa*)、櫟綠卷葉蛾(*Tortrix viridana*)、粉紋夜蛾(*Trichoplusia ni*)及雲杉小卷葉蛾(*Zeiraphera canadensis*)；

甲蟲類(鞘翅目)，例如褶窄吉丁(*Agrilus sinuatus*)、具條叩甲(*Agriotes lineatus*)、黯金針蟲(*Agriotes obscurus*)、馬鈴薯鰓金龜(*Amphimallus solstitialis*)、歐洲蛀蟲(*Anisandrus dispar*)、棉鈴象甲(*Anthonomus grandis*)、蘋果花象甲(*Anthonomus pomorum*)、線斑蝥(*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*)、灰卷葉象鼻蟲(*Byctiscus betulae*)、甜菜大龜甲(*Cassida nebulosa*)、豆葉甲(*Cerotoma trifurcata*)、甘藍莢象甲(*Ceuthorrhynchus assimilis*)、暗脈象甲(*Ceuthorrhynchus napi*)、甜菜脛跳甲(*Chaetocnema tibialis*)、煙草金針蟲(*Conoderus vespertinus*)、天冬負泥甲(*Crioceris asparagi*)、長角葉甲(*Diabrotica longicornis*)、十二星瓜葉甲(*Diabrotica 12-punctata*)、玉米根葉甲(*Diabrotica virgifera*)、墨西哥豆瓢蟲(*Epilachna varivestis*)、煙草跳甲(*Epitrix hirtipennis*)、棉莖蛀蟲

(*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*)、普通叩頭甲(*Melanotus communis*)、油菜露尾甲(*Meligethes aeneus*)、忽布鰓角金龜(*Melolontha hippocastani*)、西方五月鰓金龜(*Melolontha melolontha*)、稻負泥蟲(*Oulema oryzae*)、葡萄黑耳喙鼻蟲(*Ortiorrhynchus sulcatus*)、草莓根象甲(*Otiorrhynchus ovatus*)、芥菜甲蟲(*Phaedon cochleariae*)、葉蚤跳甲(*Phyllotreta chrysocephala*)、金龜子(*Phyllophaga sp.*)、庭園麗金龜(*Phyllopertha horticola*)、蕪菁淡足跳甲(*Phyllotreta nemorum*)、黃曲條跳甲(*Phyllotreta striolata*)、日本麗金龜(*Popillia japonica*)、豌豆葉象甲(*Sitona lineatus*)及穀象(*Sitophilus granaria*)，

雙翅類(雙翅目)，例如埃及伊蚊(*Aedes aegypti*)、刺擾伊蚊(*Aedes vexans*)、墨西哥橘實蠅(*Anastrepha ludens*)、五斑按蚊(*Anopheles maculipennis*)、地中海實蠅(*Ceratitis capitata*)、蛆症金蠅(*Chrysomya bezziana*)、美洲金蠅(*Chrysomya hominivorax*)、螺旋金蠅(*Chrysomya macellaria*)、高粱癭蚊(*Contarinia sorghicola*)、盾波蠅(*Cordylobia anthropophaga*)、五帶淡色庫蚊(*Culex*

pipiens)、瓜實蠅(*Dacus cucurbitae*)、油橄欖實蠅(*Dacus oleae*)、芸苔莢癭蚊(*Dasineura brassicae*)、黃腹廐蠅(*Fannia canicularis*)、大馬胃蠅(*Gasterophilus intestinalis*)、刺舌蠅(*Glossina morsitans*)、騷擾角蠅(*Haematobia irritans*)、桃紅癭蚊(*Haplodiplosis equesths*)、種蠅(*Hylemyia platura*)、紋皮蠅(*Hypoderma lineata*)、美洲斑潛蠅(*Liriomyza sativae*)、非洲菊斑潛蠅(*Liriomyza trifolii*)、羊綠蠅(*Lucilia caprina*)、銅綠蠅(*Lucilia cuprina*)、絲光綠蠅(*Lucilia sericata*)、黑胸尖眼蕈蚊(*Lycoria pectoralis*)、黑森麥桿蠅(*Mayetiola destructor*)、家蠅(*Musca domestica*)、廐腐蠅(*Muscina stabulans*)、羊鼻蠅(*Oestrus ovis*)、瑞典麥稈蠅(*Oscinella frit*)、甜菜潛葉蠅(*Pegomya hysocyami*)、古種蠅(*Phorbia antiqua*)、甘藍種蠅(*Phorbia brassicae*)、窄種蠅(*Phorbia coarctata*)、櫻桃實蠅(*Rhagoletis cerasi*)、蘋果實蠅(*Rhagoletis pomonella*)、牛虻(*Tabanus bovinus*)、羽衣大蚊(*Tipula oleracea*)及歐洲大蚊(*Tipula paludosa*)，

薊馬類(薊馬目)，例如煙草褐薊馬(*Frankliniella fusca*)、苜蓿薊馬(*Frankliniella occidentalis*)、花薊馬(*Frankliniella tritici*)、橘實薊馬(*Scirtothrips citri*)、稻薊馬(*Thrips oryzae*)、南黃薊馬(*Thrips palmi*)及煙薊馬(*Thrips tabaci*)，

膜翅類(膜翅目)，例如新疆菜葉蜂(*Athalia rosae*)、頭鞘軍蟻(*Atta cephalotes*)、美切軍蟻(*Atta sexdens*)、德州切葉

蟻 (*Atta texana*)、小鋸蜂 (*Hoplocampa minuta*)、龜甲鋸蜂 (*Hoplocampa testudinea*)、廚蟻 (*Monomorium pharaonis*)、火蟻 (*Solenopsis geminata*)及紅火蟻 (*Solenopsis invicta*)，

異翅類(異翅目)，例如喜綠蝽 (*Acrosternum hilare*)、多毛長蝽 (*Blissus leucopterus*)、煙草黑斑盲蝽 (*Cyrtopeltis notatus*)、棉紅蝽 (*Dysdercus cingulatus*)、麥扁紅蝽 (*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*)、甜菜檢網蝽 (*Piesma quadrata*)、紫臭蝽 (*Solubea insularis*)及蝽象 (*Thyanta perditor*)，

同翅類(同翅目)，例如豌豆蚜 (*Acyrtosiphon onobrychis*)、落葉松球蚜 (*Adelges laricis*)、鼠李馬鈴薯蚜 (*Aphidula nasturtii*)、蠶豆蚜 (*Aphis fabae*)、草莓根蚜 (*Aphis forbesi*)、蘋果蚜 (*Aphis pomi*)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)、榴蚜 (*Aphis grossulariae*)、胸喙蚜 (*Aphis schneideri*)、繡線菊蚜 (*Aphis spiraeicola*)、接骨木蚜 (*Aphis sambuci*)、豌豆蚜 (*Acyrtosiphon pisum*)、馬鈴薯長須蚜 (*Aulacorthum solani*)、薊短尾蚜 (*Brachycaudus cardui*)、圓尾蚜 (*Brachycaudus helichrysi*)、桃尾蚜 (*Brachycaudus persicae*)、梅蚜 (*Brachycaudus prunicola*)、甘藍蚜 (*Brevicoryne brassicae*)、綠洋薊蚜 (*Capitophorus horni*)、棉蚜 (*Cerosipha gossypii*)、草莓毛管蚜 (*Chaetosiphon*

fragaefolii)、深紅蚜(*Cryptomyzus ribis*)、銀樅綿蚜(*Dreyfusia nordmannianae*)、鳳仙花根瘤球蚜(*Dreyfusia piceae*)、蘋果根瘤蚜(*Dysaphis radicola*)、指頂花無網長管蚜(*Dysaulacorthum pseudosolani*)、蘋粉紅劣蚜(*Dysaphis plantaginea*)、梨蚜(*Dysaphis pyri*)、蠶豆微葉蟬(*Empoasca fabae*)、梅大尾蚜(*Hyalopterus pruni*)、苦苣菜屬蚜(*Hyperomyzus lactucae*)、麥長管蚜(*Macrosiphum avenae*)、大戟長管蚜(*Macrosiphum euphorbiae*)、薔薇長管蚜(*Macrosiphon rosae*)、蠶豆修尾蚜(*Megoura viciae*)、黍蚜(*Melanaphis pyrae*)、薔薇麥蚜(*Metopolophium dirhodum*)、綠桃蚜(*Myzodes persicae*)、冬蔥蚜(*Myzus ascalonicus*)、櫻桃黑瘤額蚜(*Myzus cerasi*)、大桃蚜(*Myzus varians*)、萵苣蚜(*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 pyri*)、冬蔥縊瘤蚜(*Rhopalomyzus ascalonicus*)、玉米縊管蚜(*Rhopalosiphum maidis*)、禾穀縊管蚜(*Rhopalosiphum padi*)、蘋果-草蚜(*Rhopalosiphum insertum*)、百合西圓尾蚜(*Sappaphis mala*)、斑點蘋果蚜(*Sappaphis mali*)、麥二叉蚜(*Schizaphis graminum*)、梨根綿蚜(*Schizoneura lanuginosa*)、麥長管蚜(*Sitobion avenae*)、溫室白粉虱(*Trialeurodes vaporariorum*)、大桔蚜(*Toxoptera aurantii*)及葡萄根瘤蚜(*Viteus vitifolii*)；

白蟻類(等翅目)，例如黃頸木白蟻(*Calotermes flavicollis*)、黃肢散白蟻(*Leucotermes flavipes*)、南歐網紋白蟻(*Reticulitermes lucifugus*)及納塔爾白蟻(*Termes natalensis*)；

直翅類(直翅目)，例如家蟋蟀(*Acheta domestica*)、東方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、德國小蠊(*Blattella germanica*)、歐洲地蜈蚣(*Forficula auricularia*)、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*)、美洲大蠊(*Periplaneta americana*)、美洲蚱蜢(*Schistocerca americana*)、棕尾蚱蜢(*Schistocerca peregrina*)、摩洛哥蟲(*Stauronotus maroccanus*)及駝背蟋蟀(*Tachycines asynamorus*)；

蛛形綱，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*)、波斯隱喙蜱(*Argas persicus*)、具環方頭蜱(*Boophilus annulatus*)、無紋方頭蜱(*Boophilus decoloratus*)、微小牛蜱(*Boophilus microplus*)、森林矩頭蜱(*Dermacentor silvarum*)、元寶玻眼蜱(*Hyalomma truncatum*)、羊硬蜱(*Ixodes ricinus*)、紅硬蜱(*Ixodes*

rubicundus)、喙蟬 (*Omithodorus moubata*)、耳殘喙蟬 (*Otobius megnini*)、雞皮刺蟎 (*Dermanyssus gallinae*)、羊癢蟎 (*Psoroptes ovis*)、扇頭壁虱 (*Rhipicephalus appendiculatus*)、紅壁虱 (*Rhipicephalus evertsi*)、疥蟎 (*Sarcoptes scabiei*)，以及癭蟎科 (*Eriophyidae spp.*)，例如蘋刺癭蟎 (*Aculus schlechtendali*)、橘鏽蟎 (*Phyllocoptrata oleivora*) 及柑桔癭蟎 (*Eriophyes sheldoni*)；埃蟬 (*Tarsonemidae spp.*)，諸如櫻草狹膚線蟎 (*Phytonemus pallidus*) 及側多食跗線蟎 (*Polyphagotarsonemus latus*)；偽葉蟎 (*Tenuipalpidae spp.*)，諸如紫偽葉蟎 (*Brevipalpus phoenicis*)；葉蟎 (*Tetranychidae spp.*)，諸如朱砂葉蟎 (*Tetranychus cinnabarinus*)、神澤氏葉蟎科 (*Tetranychus kanzawai*)、太平洋紅葉蟎 (*Tetranychus pacificus*)、棉紅蜘蛛 (*Tetranychus tetarius*) 及棉葉蟎科 (*Tetranychus urticae*)、歐洲葉蟎 (*Panonychus ulmi*)、全爪蟎 (*Panonychus citri*) 及草地蟎 (*oligonychus pratensis*)；

線蟲類，包括植物寄生線蟲類及包括生活在土壤中之線蟲類。植物寄生線蟲包括，諸如根結線蟲類、北方根結線蟲 (*Meloidogyne hapla*)、六稜柱根結線蟲 (*Meloidogyne incognita*)、爪哇根結線蟲 (*Meloidogyne javanica*) 以及其他根結線物種；形成孢囊之線蟲類，馬鈴薯金線蟲 (*Globodera rostochiensis*) 以及其他金線蟲物種；禾穀類胞囊線蟲 (*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*)，及其他孢囊線蟲物種；種子樹癭線蟲類，粒線蟲物種(*Anguina species*)；莖幹及葉線蟲類，滑刃線蟲物種(*Aphelenchoides species*)；芒刺線蟲類，長針刺線蟲(*Belonolaimus longicaudatus*)及其他刺線蟲物種；松木線蟲類，松材線蟲(*Bursaphelenchus xylophilus*)及其他松材線蟲物種；環線蟲類，環線蟲物種(*Criconema species*)、環紋線蟲物種(*Criconemella species*)、似環線蟲物種(*Criconemoides species*)、中環紋線蟲物種(*Mesocriconema species*)；莖幹及鱗莖線蟲類，馬鈴薯腐敗線蟲(*Ditylenchus destructor*)、甘薯莖線蟲病(*Ditylenchus dipsaci*)及其他莖線蟲物種(*Ditylenchus species*)；錐線蟲類，錐線蟲物種(*Dolichodorus species*)；螺旋形線蟲類，百節螺旋形墊刃線蟲(*Helicotylenchus multincinctus*)及其他螺旋線蟲物種(*Helicotylenchus species*)；鞘及鞘殼線蟲，鞘線蟲物種(*Hemicycliophora species*)及半輪線蟲物種(*Hemicriconemoides species*)；松樹線蟲物種(*Hirshmanniella species*)；矛狀線蟲類，冠線蟲物種(*Hoploaimus species*)；假性根結線蟲類，珍珠線蟲物種(*Nacobbus species*)；針線蟲類，長針線蟲(*Longidorus elongatus*)及其他長針屬物種(*Longidorus species*)；根腐線蟲類(*Pin nematodes*)，花斑根腐線蟲(*Pratylenchus neglectus*)、穿刺根腐線蟲(*Pratylenchus penetrans*)、拱根腐線蟲(*Pratylenchus curvatus*)、香蕉根腐線蟲(*Pratylenchus goodeyi*)及其他根腐線蟲物種(*Pratylenchus*

species)；穿孔線蟲類(*Burrowing nematodes*)，香蕉穿孔線蟲(*Radopholus similis*)及其他穿孔線蟲物種(*Radopholus species*)；腎形線蟲類，褐螺旋線蟲(*Rotylenchus robustus*)及其他螺旋線蟲物種(*Rotylenchus species*)；盾狀線蟲物種(*Scutellonema species*)；殘根線蟲類(*Stubby root nematodes*)，切根線蟲(*Trichodorus primitivus*)及其他毛刺線蟲物種(*Trichodorus species*)、擬毛刺線蟲物種(*Paratrichodorus species*)；阻長線蟲類(*Stunt nematodes*)，皮溝矮化線蟲(*Tylenchorhynchus claytoni*)、猶豫矮化線蟲(*Tylenchorhynchus dubius*)及其他矮化線蟲物種(*Tylenchorhynchus species*)；柑橘線蟲類，柑橘線蟲物種(*Tylenchulus species*)；劍線蟲類(*Dagger nematodes*)，劍線蟲物種(*Xiphinema species*)及其他植物寄生線蟲之物種。

化合物I及含有其之組合物尤其適用於控制昆蟲及線蟲。

此外，化合物I及含有其之組合物尤其適用於控制選自同翅目、鱗翅目、雙翅目、纓翅目及線蟲綱之害蟲。

在本發明之較佳實施例中，使用式I化合物用於控制昆蟲或蛛形蟲，尤其鱗翅目、鞘翅目及同翅目之昆蟲及蟬蟬目之蛛形蟲。根據本發明之式I化合物尤其適用於控制鱗翅目及同翅目之昆蟲。

調配物

為使用於根據本發明之方法中，化合物I可轉化成常規

調配物，例如溶液、乳液、懸浮液、散劑、粉劑、糊劑、顆粒劑及可直接噴霧之溶液。使用之形式視特定之目的及施用方法而定。選擇調配物及施用方法以確保根據本發明之式I化合物在所有情況下精細且均勻分佈。

以已知之方式(關於回顧請參看(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, 第四版, McGraw-Hill, New York, 1963, 第8-57頁以及下列WO 91/13546、US 4,172,714、US 4,144,050、US 3,920,442、US 5,180,587、US 5,232,701、US 5,208,030、GB 2,095,558、US 3,299,566、Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961、Hance等人, Weed Control Handbook, 第八版, 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))例如藉由用適用於調配農業化學品的助劑(諸如溶劑及/或載劑, (必要時)乳化劑、界面活性劑及分散劑、防腐劑、消泡劑、防凍劑)視情況亦適用於種子處理調配物之助劑(著色劑及/或黏合劑及/或膠凝劑)擴展活性化合物來製備調配物。

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、苜醇)，酮(例如環己酮、 γ -丁內酯)，吡咯啉酮(N-甲基吡咯啉酮(NMP)、N-辛基吡咯啉酮NOP)，乙酸酯(乙二醇二乙酸酯)，乳酸烷基酯，內酯(諸如 γ -丁內酯)，二醇，脂肪酸二甲醯胺，脂肪酸及脂肪酸酯，甘油三酯，植物或動物來源之油及改質油(諸如烷基化植物油)。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、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，諸如穀類粕粉、樹皮粉、木粉及堅果殼粉、纖維素粉及其他固體載劑。

合適之乳化劑為非離子及陰離子乳化劑(例如聚氧化乙烯脂肪醇醚、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下列物質之鹼金屬鹽、鹼土金屬鹽及銨鹽：木質磺酸、萘磺酸、酚磺酸、二丁基萘磺酸、烷基芳基磺酸鹽、烷基硫酸鹽、烷基磺酸鹽、脂肪醇硫酸酯、脂肪酸及硫酸化脂肪醇二醇醚、以及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、聚氧化乙烯辛基苯基醚、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、三硬脂鹽基苯基聚乙二醇醚、烷基芳基聚醚醇、醇及脂肪醇/環氧乙烷縮合物、乙氧基化蓖麻油、聚氧化乙烯烷基醚、乙氧基化聚氧化丙烯、月桂醇聚乙二醇醚乙縮醛、山梨糖醇酯。

亦可將諸如甘油、乙二醇、丙二醇之防凍劑及諸如此類之殺菌劑添加至調配物中。

合適之消泡劑為(例如)基於矽或硬脂酸鎂之消泡劑。

合適之防腐劑為(例如)二氯酚及苧醇半甲縮醛。

合適之增稠劑為賦予調配物以假塑性流動特性(亦即靜止時具有高黏度而在攪拌階段具有低黏度)之化合物。在本文中亦可提及(例如)基於多醣之市售增稠劑，諸如 Xanthan Gum®(來自 Kelco 之 Kelzan®)，Rhodopol® 23 (Rhone Poulenc)或 Veegum®(來自 R.T. Vanderbilt)或基於有機頁矽酸鹽之市售增稠劑，諸如 Attaclay®(來自 Engelhardt)。適合於根據本發明之分散液的消泡劑為(例如)聚矽氧乳液(諸如 Silikon® SRE、Wacker 或來自 Rhodia 之 Rhodorsil®)、長鏈醇、脂肪酸、有機氟化合物及其混合物。可添加殺生物劑以穩定根據本發明之組合物以防微生物之侵襲。合適之殺生物劑係(例如)基於異噻唑酮，諸如 Avecia(或 Arch)以商標 Proxel® 出售之化合物或 Thor Chemie 以 Acticide® RS 出售之化合物及 Rohm & Haas 以 Kathon® MK 出售之化合物。合適之防凍劑為有機多元醇，例如乙二醇、丙二醇或甘油。其通常以活性化合物組

合物之總重量計不超過10重量%之量採用。若適當，根據本發明之活性化合物組合物可包含以所製備之調配物總量計1重量%至5重量%的緩衝劑以調節pH值，所使用之緩衝劑的量及類型視活性化合物之化學性質而定。緩衝劑之實例為無機或有機弱酸(諸如磷酸、硼酸、乙酸、丙酸、檸檬酸、反丁烯二酸、酒石酸、草酸及丁二酸)之鹼金屬鹽。

適合製備可直接噴霧之溶液、乳液、糊劑或油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，以及煤焦油及植物或動物來源之油，脂族、環狀及芳族烴，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，例如二甲亞砷、N-甲基吡咯啉酮及水。

粉劑、供展布用物質及散劑可藉由將活性物質與固體載劑混合或共同研磨來製備。

顆粒劑，例如包衣顆粒、浸漬顆粒及均質顆粒可藉由使活性成份與固體載劑黏合來製備。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、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，諸如穀類粕粉、樹皮粉、木粉及堅果殼粉、纖維素粉及其他固體載劑。

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。活性成份以(根據NMR光譜)90%至100%，較佳95%至100%之純度採用。

出於種子處理之目的，可將各別調配物稀釋2-10倍以使得預備使用之製劑中活性化合物重量濃度為0.01重量%至60重量%，較佳0.1重量%至40重量%。

同樣地，式I化合物可以其調配物形式或由其製備之使用形式(例如以可直接噴霧之溶液、粉劑、懸浮液或分散液、乳液、油分散液、糊劑、可撒布之產品、供展布用之物質或顆粒劑形式)藉助於噴霧、霧化、撒布、展布或傾倒來使用。使用形式完全視預定目的而定；其意欲確保在各情況下根據本發明之活性化合物盡可能最精細之分佈。

水性使用形式可自乳液濃縮物、糊劑或可濕性粉劑(可噴霧粉劑、油分散液)藉由添加水來製備。為製備乳液、糊劑或油分散液，可藉助於濕潤劑、增黏劑、分散劑或乳化劑將單獨或溶解於油或溶劑中之物質於水中均質化。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(若適當)溶劑或油之濃縮物，且該等濃縮物適於用水稀釋。

預備使用之產物中的活性成份濃度可在相對較寬的範圍內變化。一般而言，其為0.0001重量%至10重量%，較佳0.01重量%至1重量%。

活性成份亦可成功地以超低量法(ULV)使用，可能施用包含95重量%以上活性成份之調配物，或甚至施用不含添加劑之活性成份。

以下為調配物之實例：

1.用於用水稀釋之產物。出於種子處理之目的，該等產物可在經稀釋或未經稀釋的情況下施用於種子。

A)水溶性濃縮物(SL，LS)

將10重量份之活性化合物溶解於90重量份之水或水溶性溶劑中。或者添加濕潤劑或其他助劑。在用水稀釋後，活性化合物溶解，藉此獲得具有10% (w/w)活性化合物的調配物。

B)可分散之濃縮物(DC)

將20重量份之活性化合物溶於70重量份之環己酮中，且添加10重量份之例如聚乙烯吡咯啉酮之分散劑。用水稀釋得到分散液，藉此獲得具有20% (w/w)活性化合物之調配物。

C)可乳化之濃縮物(EC)

將15重量份之活性化合物溶解於7重量份之二甲苯中，且添加十二烷基苯磺酸鈣及蓖麻油乙氧化物(在各情況下5重量份)。用水稀釋得到乳液，藉此獲得具有15% (w/w)活性化合物之調配物。

D)乳液(EW、EO、ES)

將25重量份之活性化合物溶解於35重量份之二甲苯中，且添加十二烷基苯磺酸鈣及蓖麻油乙氧化物(在各情況下5重量份)。藉助於乳化器(例如Ultraturrax)將該混合物引入30重量份之水中並將其製成均質乳液。用水稀釋得到乳液，藉此獲得具有25% (w/w)活性化合物之調配物。

E)懸浮液(SC、OD、FS)

在攪動式球磨機中粉碎20重量份之活性化合物且添加10重量份之分散劑、濕潤劑及70重量份之水或有機溶劑以得到精細活性化合物懸浮液。用水稀釋得到活性化合物之穩定懸浮液，藉此獲得具有20% (w/w)活性化合物之調配物。

F)水可分散之顆粒劑及水溶性顆粒劑(WG、SG)

精細研磨50重量份之活性化合物且添加50重量份之分散劑及濕潤劑並藉助於工業設備(例如擠壓、噴霧塔、流化床)將其製成水可分散或水溶性之顆粒劑。用水稀釋得到活性化合物之穩定分散液或溶液，藉此獲得具有50% (w/w)活性化合物之調配物。

G)水可分散之粉劑及水溶性粉劑(WP、SP、SS、WS)

於轉子定子研磨機中研磨75重量份之活性化合物且添加25重量份之分散劑、濕潤劑及矽膠。用水稀釋得到活性化合物之穩定分散液或溶液，藉此獲得具有75% (w/w)活性化合物之調配物。

H)凝膠調配物(GF)

在攪動式球磨機中粉碎20重量份之活性化合物且添加10重量份之分散劑、1重量份之膠凝劑、濕潤劑及70重量份之水或有機溶劑以得到精細活性化合物懸浮液。用水稀釋得到活性化合物之穩定懸浮液，藉此獲得具有20% (w/w)活性化合物之調配物。

2.在未經稀釋之情況下應用於葉數之產物。出於種子處理

之目的，該等產物可在經稀釋或未經稀釋的情況下施用於種子。

I)可撒布之粉劑(DP、DS)

將5重量份之活性化合物精細研磨並與95重量份細粉狀高嶺土精細混合。以此方式得到具有5% (w/w)活性化合物之可撒布產物。

J)顆粒劑(GR、FG、GG、MG)

將0.5重量份之活性化合物精細研磨並與95.5重量份之載劑締合，藉此獲得具有0.5% (w/w)之活性化合物的調配物。現有方法為擠壓、噴霧乾燥或流化床。以此方式得到在未經稀釋的情況下施用之葉用顆粒劑。

K)ULV溶液(UL)

將10重量份之活性化合物溶解於90重量份之有機溶劑(例如二甲苯)中。以此方式得到具有10% (w/w)之活性化合物的產物，其在未經稀釋的情況下供葉用。

可將多種類型之油、濕潤劑、佐劑、除草劑、殺真菌劑、其他殺蟲劑或殺菌劑添加至活性成份中，若適當僅於使用前一刻添加(槽式混合)。該等藥劑通常以1:10至10:1之重量比與根據本發明之藥劑混合。

本發明之化合物I的化合物及組合物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、諸如硝酸銨、尿素、碳酸鉀及過磷酸鹽之肥料、植物毒素及植物生長調節劑、安全劑及殺線蟲劑一起施用。該等額外成份可依序或與上述組合物組合使用，若適當亦僅於使用前

一刻添加(槽式混合)。舉例而言，可在用其他活性成份處理之前或之後向植物噴灑本發明之組合物。

該等額外試劑可以1:10至10:1之重量比與根據本發明使用之試劑混合。將以殺蟲劑之使用形式的化合物I或包含其之組合物與其他殺蟲劑混合通常產生較廣之殺蟲作用範圍。

以下殺蟲劑(根據本發明之化合物可連同其使用且經由該等殺蟲劑可產生可能之協同效應)之清單M意欲說明可能之組合，而不意欲加以任何限制：

M.1.有機(硫代)磷酸鹽：乙醯甲胺磷(acephate)、甲基吡啶磷(azamethiphos)、穀硫磷(azinphos-methyl)、毒死蜱(chlorpyrifos)、甲基毒死蜱(chlorpyrifos-methyl)、毒蟲畏(chlorfenvinphos)、二嗪農(diazinon)、敵敵畏(dicrotophos)、百治磷(dicrotophos)、樂果(dimethoate)、乙拌磷(disulfoton)、乙硫磷(ethion)、殺螟松(fenitrothion)、倍硫磷(fenthion)、異噁唑磷(isoxathion)、馬拉硫磷(malathion)、甲胺磷(methamidophos)、殺撲磷(methidathion)、甲基對硫磷(methyl-parathion)、速滅磷(mevinphos)、久效磷(monocrotophos)、乙醯甲胺磷(oxydemeton-methyl)、對氧磷(paraoxon)、對硫磷(parathion)、稻豐散(phenthoate)、伏殺磷(phosalone)、亞胺硫磷(phosmet)、磷胺(phosphamidon)、甲拌磷(phorate)、腈肟磷(phoxim)、蟲蟎磷(Pirimiphos-methyl)、丙溴磷(profenofos)、丙硫磷(prothiofos)、殺普松(sulprophos)、

殺蟲畏(tetrachlorvinphos)、託福松(terbufos)、三唑磷(triazophos)、三氯松(trichlorfon)；

M.2. 胺基甲酸鹽(Carbamate)：棉靈威(alanycarb)、得滅克(aldicarb)、苯惡威(bendiocarb)、本夫克(benfuracarb)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、丁基加保扶(carbosulfan)、芬諾西克(fenoxycarb)、夫硫克(furathiocarb)、滅蟲威(methiocarb)、滅多蟲(methomyl)、草胺鹽(oxamyl)、抗蚜威(pirimicarb)、殘殺威(propoxur)、硫雙威(thiodicarb)、唑蚜威(triazamate)；

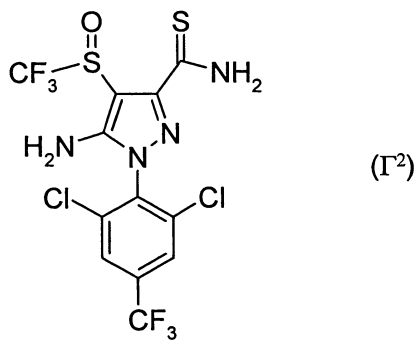
M.3. 合成除蟲菊酯(Pyrethroid)：丙烯除蟲菊酯(allethrin)、畢芬寧(bifenthrin)、西福寧(cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、苯醚氰菊酯(cyphenothrin)、氯氰菊酯(cypermethrin)、 α -氯氰菊酯(alpha-cypermethrin)、 β -氯氰菊酯(beta-cypermethrin)、 ξ -氯氰菊酯(zeta-cypermethrin)、第滅寧(deltamethrin)、烯炔菊酯(empenthrin)、氰戊菊酯(esfenvalerate)、依芬寧(etofenprox)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、炔咪菊酯(imiprothrin)、 λ -賽洛寧(lambda-cyhalothrin)、百滅寧(permethrin)、炔丙菊酯(prallethrin)、除蟲菊素(pyrethrin)I 及 II、滅蟲菊(resmethrin)、西拉福芬(silafluofen)、 τ -福化利(tau-fluvalinate)、七氟菊酯(tefluthrin)、胺菊酯(tetramethrin)、四溴菊酯(tralomethrin)、四氟菊酯(transfluthrin)、丙氟菊酯(profluthrin)、四氟甲醚菊酯

(dimefluthrin)；

M.4. 生長調節劑：a) 甲殼素合成抑制劑：苯甲醯基脲 (benzoylureas)：克福隆 (chlorfluazuron)、二福隆 (diflubenzuron)、福環脲 (flucycloxuron)、氟芬隆 (flufenoxuron)、六伏隆 (hexaflumuron)、祿芬隆 (lufenuron)、諾華隆 (novaluron)、得福隆 (teflubenzuron)、殺蟲隆 (triflumuron)；布芬淨 (buprofezin)、戴芬蘭 (diofenolan)、合賽多 (hexythiazox)、伊妥罌坐 (etoxazole)、克芬蟎 (clofentazine)；b) 蛻皮激素拮抗劑：鹵芬載 (halofenozide)、甲氧芬載 (methoxyfenozide)、得布芬載 (tebufenozide)、印棟素 (azadirachtin)；c) 類幼年素：比普西芬 (pyriproxyfen)、美賜年 (methoprene)、芬諾西克 (fenoxycarb)；d) 脂質生物合成抑制劑：螺蟎酯 (spirodiclofen)、螺甲蟎酯 (spiromesifen)、螺四蟎酯 (spirotetramat)；

M.5. 煙鹼受體促效劑 / 拮抗劑化合物：可尼丁 (clothianidin)、達特南 (dinotefuran)、吡蟲啉 (imidacloprid)、噻蟲嗪 (thiamethoxam)、烯啶蟲胺 (nitenpyram)、啉蟲脒 (acetamiprid)、噻蟲啉 (thiacloprid) 及 AKD-1022；

M.6. GABA拮抗劑化合物：乙醯蟲清 (acetoprole)、硫丹 (endosulfan)、乙蟲清 (ethiprole)、氟蟲腈 (fipronil)、香草蟲清 (vaniliprole)、吡氟蟲清 (pyrafluprole)、吡蟲清 (pyriprole)、式 Γ^2 之苯基吡啶化合物



M.7. 巨環內酯殺蟲劑：阿巴美丁(abamectin)、伊曼美丁(emamectin)、密滅汀(milbemectin)、雷匹滅汀(lepimectin)、賜諾殺(spinosad)；

M.8. METI I 化合物：芬那劄奎(fenazaquin)、比達本(pyridaben)、得布芬比(tebufenpyrad)、啞蟲醯胺(tolfenpyrad)、氟芬納林(flufenimer)；

M.9. METI II及III化合物：阿色奎西(acequinocyl)、弗阿塞平(flucyprim)、伏蟻脞(hydramethylnon)；

M.10. 解偶聯劑化合物：蟲蟎腈(chlorfenapyr)；

M.11. 氧化磷酸化抑制劑化合物：環己錫(cyhexatin)、戴芬西隆(diafenthiuron)、苯丁錫(fenbutatin oxide)、克蟎特(propargite)；

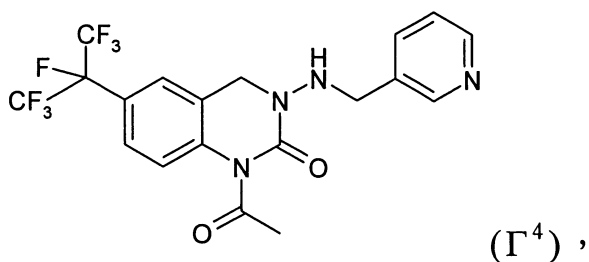
M.12. 蛻皮破裂劑化合物：西洛美秦(cyromazine)；

M.13. 混合功能氧化酶抑制劑化合物：胡椒基丁醚(piperonyl butoxide)；

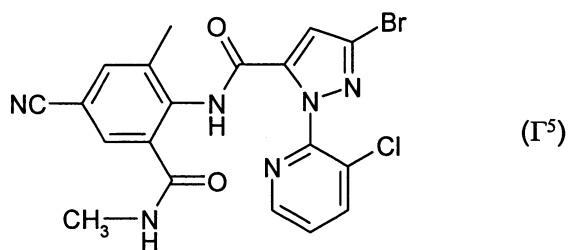
M.14. 鈉通道阻斷劑化合物：引多殺克(indoxacarb)、美塔氟米宗(metaflumizone)；

M.15. 其他：三亞蟎(amitraz)、本克羅塞茲(benclothiaz)、畢芬載(bifenazate)、培丹(cartap)、氟啞蟲

醯胺 (flonicamid)、啖蟲丙醚 (pyridalyl)、比美卓秦 (pymetrozine)、硫、硫環蘭 (thiocyclam)、氟苯二醯胺 (flubendiamide)、賽恩諾匹拉芬 (cyenopyrafen)、吡氟硫磷 (flupyrzofos)、賽氟美托芬 (cyflumetofen)、醯胺氟美特 (amidoflumer)、吡氟喹納宗 (pyrifluquinazon)、式 Γ^4 之胺基喹啉酮化合物，



N-R'-2,2-二鹵基-1-R''環-丙烷羧醯胺-2-(2,6-二氯- α,α,α -三-氟-對甲苯基)脞或 N-R'-2,2-二(R''')丙醯胺-2-(2,6-二氯- α,α,α -三-氟-對甲苯基)-脞，其中 R' 為甲基或乙基，鹵基為氯或溴，R'' 為氫或甲基，且 R''' 為甲基或乙基，如氯恩蟲清 (chlorantraniliprole) 之鄰胺基苯甲醯胺化合物或式 Γ^5 之化合物，



及丙二腈化合物(如 JP 2002 284608、WO 02/89579、WO 02/90320、WO 02/90321、WO 04/06677、WO 04/20399、JP 2004 99597、WO 05/68423、WO 05/68432 或 WO 05/63694 中所述)，尤其丙二腈化合物 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}$

$(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ 、 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_5\text{CF}_2\text{H}$ 、
 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{F}$ 、 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2$
 $(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ 、 $\text{CF}_2\text{H}(\text{CF}_2)_3\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ 、
 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ 、 $\text{CF}_3(\text{CF}_2)_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ 及
 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ 。

在其他出版物中，市售群 M 之化合物可見於 The Pesticide Manual，第 13 版，British Crop Protection Council (2003)。WO 98/28279 中已描述式 Γ^2 之硫醯胺及其製備。Lepimectin 自 Agro Project, PJB Publications Ltd, 2004 年 11 月已知。EP-A1 454621 中已描述 benclonthiaz 及其製備。Farm Chemicals Handbook，第 88 卷，Meister Publishing Company, 2001 中已描述殺撲磷及對氧磷及其製備。WO 98/28277 中已描述 Acetoprole 及其製備。EP-A1 462 456 中已描述 Metaflumizone 及其製備。Pesticide Science 54, 1988，第 237-243 頁及 US 4822779 中已描述 Flupyrzofos。JP 2002193709 及 WO 01/00614 中已描述 Pyrafluprole 及其製備。WO 98/45274 及 US 6335357 已描述吡蟲清及其製備。US 6221890 及 JP 21010907 中已描述 Amidoflumet 及其製備。WO 03/007717 及 WO 03/007718 中已描述 Flufenerim 及其製備。WO 04/080180 中已描述 Cyflumetofen 及其製備。EP A 109 7932 中已描述式 Γ^4 之胺基喹唑啉酮化合物。

WO 01/70671；WO 02/48137；WO 03/24222，WO 03/15518，WO 04/67528；WO 04/33468；及 WO 05/118552 中

已描述如式 Γ^5 之一者或如 chloranthraniliprole 之鄰胺基苯甲醯胺及其製備。WO 05/63694 中已描述丙二腈化合物 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ 、 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_5\text{CF}_2\text{H}$ 、 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{F}$ 、 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ 、 $\text{CF}_2\text{H}(\text{CF}_2)_3\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ 、 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ 、 $\text{CF}_3(\text{CF}_2)_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ 及 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ 。

殺真菌混合搭配物為彼等選自由下列各物組成之群 F 的物質：

F.1 醯基丙胺酸，諸如苯霜靈 (benalaxyl)、滅達樂 (metalaxyl)、呋醯胺 (ofurace)、歐殺斯 (oxadixyl)；

F.2 胺衍生物，諸如阿迪嗎啉 (aldimorph)、多寧 (dodine)、嗎菌靈 (dodemorph)、粉鏽啉 (fenpropimorph)、苯鏽啉 (fenpropidin)、雙胍鹽 (guazatine)、雙胍辛胺 (iminooctadine)、螺沙明 (spiroxamin)、三得芬 (tridemorph)；

F.3 苯胺基嘧啶，諸如派美尼 (pyrimethanil)、嘧黴胺 (mepanipyrim) 或賽洛定尼 (cyrodinyl)；

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

F.5 唑，諸如比多農 (bitertanol)、溴克唑 (bromoconazole)、環克唑 (cyproconazole)、苯醚甲環唑 (difenoconazole)、二

硝基克唑(dinitroconazole)、氟環唑(epoxiconazole)、芬克唑(fenbuconazole)、氟喹克唑(fluquiconazole)、氟矽唑(flusilazole)、己唑醇(hexaconazole)、依滅列(imazalil)、葉菌唑(metconazole)、邁克尼(myclobutanil)、平克唑(penconazole)、丙環唑(propiconazole)、撲克拉(prochloraz)、丙硫醇克唑(prothioconazole)、戊唑醇(tebuconazole)、三泰芬(triadimefon)、三泰隆(triadimenol)、賽福座(triflumizol)、環菌唑(triticonazole)、護汰芬(flutriafol)；

F.6 二甲鹽亞胺，諸如依普同(iprodion)、米克啞(myclozolin)、撲滅寧(procymidon)、免克寧(vinclozolin)；

F.7 二硫代胺基甲酸鹽，諸如福美鐵(ferbam)、代森鈉(nabam)、錳乃浦(maneb)、錳粉克(mancozeb)、威百畝(metam)、免得爛(metiram)、甲基鋅乃浦(propineb)、聚胺基甲酸酯、得恩地(thiram)、益穗(ziram)、鋅乃浦(zineb)。

F.8 雜環化合物，諸如敵菌靈(anilazine)、免賴得(benomyl)、博克利(boscalid)、貝芬替(carbendazim)、萎鏽靈(carboxin)、氧化萎鏽靈(oxycarboxin)、賽座滅(cyazofamid)、邁隆(dazomet)、腈硫醌(dithianon)、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)、

丙氧喹啉 (proquinazid)、比芬諾 (pyrifenox)、百快隆 (pyroquilon)、快諾芬 (quinoxifen)、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)；

F.9 銅殺真菌劑，諸如波爾多液 (Bordeaux mixture)、乙酸銅、鹼性氯氧化銅 (copper oxychloride)、鹼式硫酸銅；

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

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

F.12 嗜穗果傘素 (strobilurins)，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)、啖氧菌酯 (picoxystrobin) 或三氟敏 (trifloxystrobin)；

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

F.14 欣能醯胺 (cinnemamides) 及其類似物，諸如達滅芬 (dimethomorph)、氟美醯胺 (flumetover) 或氟嗎啉 (flumorph)；

F.15 硫及其他殺真菌劑，諸如酸化苯并噻二唑-S-甲酯 (acibenzolar-S-methyl)、苯噻瓦利 (benthiavalicarb)、加普

胺 (carpropamid)、四氯異苯腈 (chlorothalonil)、噻芬胺 (cyflufenamid)、霜脲氰 (cymoxanil)、邁隆 (dazomet)、噻菌清 (diclomezin)、二氯西莫 (diclocymet)、乙微威 (diethofencarb)、護粒松 (edifenphos)、乙噻博胺 (ethaboxam)、環鹽菌胺 (fenhexamid)、三苯醋錫 (fentin-acetate)、禾草靈 (fenoxanil)、噻菌脒 (ferimzone)、扶吉胺 (fluazinam)、福賽得 (fosetyl)、乙磷鋁 (fosetyl-aluminum)、顯微威 (iprovalicarb)、六氯苯、美曲芬諾 (metrafenon)、賓克隆 (pencycuron)、霜微威 (propamocarb)、苯酞 (phthalide)、甲基托洛可弗 (toloclofos-methyl)、奎脫辛 (quintozene)、氯苯鹽胺 (zoxamid)。

應用

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、蛛形蟲及線蟲)、植物、植物所生長之土壤或水與本發明之化合物I或含有其之組合物接觸。同樣，"接觸"包括直接接觸(直接將化合物/組合物施用於動物害蟲或植物上-通常施用至植物之葉、莖或根)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)。

藉由使植物/作物與殺蟲有效量之式I化合物接觸，式I化合物或包含其之殺蟲組合物可用於保護生長中之植物及作物免受動物害蟲尤其昆蟲、蟎或蛛形蟲之攻擊或侵襲。術語"作物"係指生長中與已收穫之作物。

此外，可藉由使目標害蟲、其食物來源、棲息地、繁殖

場或其所在地接觸殺蟲有效量之式I化合物來控制動物害蟲。同樣，可在所在地、生長中之作物或已收穫之作物受害蟲侵染前或後進行施用。

亦可將本發明之化合物預防性施用於預期會出現害蟲之地點。

藉由使植物與殺蟲有效量之式I化合物接觸，式I化合物亦可用於保護生長中之植物免受害蟲之攻擊或侵襲。同樣，"接觸"包括直接接觸(直接將化合物/組合物施用於動物害蟲及/或植物上-通常施用至植物之葉、莖及/或根)與間接接觸(將化合物/組合物施用至動物害蟲及/或植物之所在地)。

"所在地"意謂害蟲或寄生蟲生長或可生長之棲息地、繁殖場、植物、種子、土壤、區域、物質或環境。

一般而言，"殺蟲有效量"意謂達成對生長產生可觀測到之效應所需的活性成份之量，該等效應包括目標有機體之壞死、死亡、延遲、預防及移除、破壞之效應，或者以其他方式減弱目標有機體之出現及活性之效應。對用於本發明中之各種化合物/組合物而言，殺蟲有效量可變化。組合物之殺蟲有效量亦將根據所盛行之條件而變化，諸如所要之殺蟲效果及持續時間、氣候、目標物種、所在地、施用方式及其類似因素。

式I化合物經由接觸(經由土壤、玻璃、牆壁、蚊帳、地毯、植物部分或動物部分)與攝取(誘餌或植物部分)而起效。

為用於抵擋螞蟥、白蟻、黃蜂、蒼蠅、蚊子、蟋蟀或蟑螂，式I化合物較佳於誘餌組合物中使用。

誘餌可為液體、固體或半固體製劑(例如凝膠)。固體誘餌可形成為適於各別施用之各種形狀及形式，(例如)顆粒狀、塊狀、棒狀、盤狀。液體誘餌可裝入各種裝置中以確保適當之施用，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經調配以達到關於黏著性、保水性或老化特性方面之特定要求。

組合物中所採用之誘餌為具有足夠之吸引力以驅使諸如螞蟥、白蟻、黃蜂、蒼蠅、蚊子、蟋蟀等或蟑螂之昆蟲食用其的產物。吸引力可藉由使用激食物質或性信息素來操縱。激食物質係選自例如(但不限於)動物及/或植物蛋白質(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，或單有機糖、寡聚有機糖或多有機糖，尤其蔗糖、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、昆蟲之新鮮或腐爛部分或其特定部分亦可充當激食物質。已知性信息素更具有昆蟲特異性。特異性信息素已在文獻中描述且為熟習此項技術者所已知。

如氣霧劑(例如於噴霧罐中)、油類噴霧劑或泵噴霧劑之式I化合物的調配物高度適合非專業使用者用於控制諸如蒼蠅、跳蚤、扁虱、蚊子或蟑螂之害蟲。氣霧劑配方較佳包含活性化合物、諸如低碳數醇(例如甲醇、乙醇、丙醇、丁醇)、酮(例如丙酮、丁酮)、具有大致50℃至250℃

沸點範圍之烷烴(例如煤油)、二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯啉酮、二甲亞砷、芳族烴(諸如甲苯、二甲苯)、水之溶劑以及助劑，諸如乳化劑，諸如山梨糖醇單油酸酯，具有3-7 mol環氧乙烷之油基乙氧化物，脂肪醇乙氧化物，香料油，諸如香精油，中等碳數脂肪酸與低碳數醇之酯，芳族羰基化合物，若適當包含穩定劑，諸如苯甲酸鈉，兩性界面活性劑，低碳數環氧化物，原甲酸三乙酯且若需要包含推進劑，諸如丙烷、丁烷、氮、壓縮空氣、二甲醚、二氧化碳、氧化亞氮或該等氣體之混合物。

油噴霧劑調配物與氣霧劑配方之不同之處在於不使用推進劑。

式I化合物及其各別組合物亦可用於蚊香及熏香、煙霧筒、汽化器板或長期汽化器中，且亦可用於防蚊紙、防蚊墊或其他加熱獨立式汽化器系統中。

以式I化合物及其各別組合物來控制由昆蟲傳播之傳染性疾病的方法亦包含處理棚屋及房屋之表面，空氣噴塗及浸漬窗簾、帳幕、衣物、蚊帳、采蠅捕集器或其類似物。用於施用於纖維、織物、針織物、非織物、結網材料或箔及篷帆布之殺蟲劑組合物較佳包含包括殺蟲劑、視情況之忌避劑及至少一種黏合劑的混合物。合適之忌避劑為(例如)N,N-二乙基-間甲苯甲醯胺(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、避蟲酮(indalone)、甲基新癸醯胺(MNDA)、非用於昆蟲控制之合

成除蟲菊酯，諸如{(+/-)-3-烯丙基-2-甲基-4-側氧基環戊-2-(+)-烯基-(+)-反菊酸酯(賜百寧(Esbiothrin))，衍生自或等同於植物萃取物之忌避劑，該等植物萃取物如檸檬烯、丁香酚、(+)-桉醇(1)((+)-由卡瑪醇(Eucamalol)(1))、(-)-1-表桉醇或來自如檸檬桉(*Eucalyptus maculata*)、白背蔓荊(*Vitex rotundifolia*)、馬丁香茅(*Cymbopogon martinii*)、檸檬香茅(*Cymbopogon citratus*)(檸檬草)、精香茅草(*Cymbopogon nardus*)(香茅)之植物的粗製植物萃取物。合適之黏合劑係選自下列物質之聚合物及共聚物：(例如)脂族酸之乙烯基酯(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、2-乙基己基丙烯酸酯及丙烯酸甲酯)、單及雙烯系不飽和烴(諸如苯乙烯)及脂族二烯(諸如丁二烯)。

一般藉由將織物材料浸入殺蟲劑之乳液或分散液中或將其噴於帳上來進行窗簾及蚊帳之浸漬。

式I化合物及其組合物可用於保護木質材料(諸如樹、木板柵欄、枕木等)及建築物(諸如房屋、外屋、工廠)以及建築材料、傢具、皮革、纖維、乙烯基物件、電線及電纜等免受螞蟻及/或白蟻侵害，且可用於控制螞蟻及白蟻對作物或人類產生危害(例如當該等害蟲侵入房屋及公共設施中時)。式I化合物不僅可施用至環境土壤表面或施用至地下土壤中以保護木質材料，且其亦可施用至木材物件(諸如地下混凝土表面、凹柱(alcove post)、橫樑、膠合板、傢具等)木質物件(諸如粒子板、半板等)及乙烯基物件(諸

如經塗覆之電線、乙烯基片材、諸如苯乙烯發泡體之絕熱材料等)。在施藥以防止螞蟻對作物或人類產生危害的情況下，將本發明之螞蟻控制劑施用至作物或環境土壤，或直接施用至蟻穴等等。

在土壤處理或施用至害蟲棲息地或巢穴的情況下，活性成份之量在每100平方公尺0.0001 g至500 g，較佳每100平方公尺0.001 g至20 g之範圍內。

在材料保護中之常規施用率為(例如)每平方公尺經處理之材料0.01 g至1000 g活性化合物，合意地為每平方公尺0.1 g至50 g。

用於材料浸漬中之殺蟲劑組合物通常含有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%之至少一種忌避劑及/或殺蟲劑。

為用於誘餌組合物中，活性成份之典型含量為0.001重量%至15重量%，合意地為0.001重量%至5%重量%之活性化合物。

為用於噴霧組合物中，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%。

為用於處理作物植物，本發明之活性成份的施用率在每公頃0.1 g至4000 g，合意地每公頃25 g至600 g，更合意地每公頃50 g至500 g的範圍內。

種子處理

式I化合物亦適於種子處理以保護種子免受昆蟲害蟲侵

害，尤其免受土生昆蟲害蟲侵害，且保護所得植物之根及芽抵擋土壤害蟲及食葉昆蟲。

式I化合物尤其適用於保護種子免受土壤害蟲侵害且保護所得植物之根及芽抵擋土壤害蟲及食葉昆蟲。保護所得植物之根及芽較佳。保護所得植物之芽免受刺穿類及吮吸類昆蟲侵害更佳，其中保護其免受蚜蟲侵害最佳。

因此本發明包含保護種子免受昆蟲侵害，尤其免受土壤昆蟲侵害，及保護幼苗之根及芽免受昆蟲侵害，尤其免受土壤及食葉昆蟲侵害的方法，該方法包含在播種前及/或發芽處理後使種子與通式I之化合物或其鹽接觸。尤其較佳之方法為其中植物之根及芽受到保護之方法，更佳為其中植物之芽受保護而免受刺穿類及吮吸類昆蟲侵害之方法，最佳為其中植物芽受保護而免受蚜蟲侵害之方法。

術語種子包含種子及包括(但不限於)真種子、種塊(seed piece)、分蘗、球莖、鱗莖、果實、塊莖、穀粒、插條、插芽及其類似物之所有類型之植物繁殖體，且在較佳實施例中意謂真種子。

術語種子處理包含此項技術中已知之所有合適之種子處理技術，諸如拌種、種子塗覆、撒種(seed dusting)、浸種及種子丸化。

本發明亦包含用活性化合物塗覆或含有活性化合物之種子。

術語"經塗覆及/或含有"一般表示儘管視施用方法而定，較大或較少部分之成份可滲入繁殖產物中，但在施用時活

性成份大部分係處於繁殖產物表面上。當(再)栽種該繁殖產物時，其可吸收該活性成份。

合適之種子為穀物、根類作物、油類作物、蔬菜、香辛料、觀賞植物之種子，例如硬粒小麥及其他小麥、大麥、燕麥、黑麥、玉蜀黍(飼用玉蜀黍及甜玉蜀黍/甜玉米及非甜質玉米)、大豆、油類作物、十字花科植物、棉、向日葵、香蕉、稻、油籽油菜、蕪菁油菜、甜菜、飼用甜菜、茄子、馬鈴薯、牧草、草地草、草坪草、飼用草、番茄、韭、番瓜/南瓜、甘藍菜、球莖莧苣、胡椒、黃瓜、甜瓜、甘藍類、甜瓜、菜豆、豌豆、大蒜、洋蔥、胡蘿蔔、諸如馬鈴薯之塊莖類植物、甘蔗、煙草、葡萄、矮牽牛、老鸛草/天竺葵、三色堇及鳳仙花之種子。

此外，活性化合物亦可用於處理由於育種(包括遺傳工程方法)而耐除草劑或殺真菌劑或殺蟲劑之作用的植物種子。

舉例而言，活性化合物可用於處理耐受選自由下列各物組成之群之除草劑的植物種子：磺酰脲、咪唑啉酮、草銨腓或草甘膦異丙銨及類似活性物質(參看例如 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抗某些害蟲之蘇雲金桿菌毒素(Bt毒素)的棉(EP-A-0142924，EP-A-0193259))中。

此外，活性化合物亦可用於處理相較於現有植物組成具有經改質之特徵的植物種子，該等植物可(例如)藉由傳統

育種法及/或產生突變或藉由重組程序而產生。舉例而言，已描述多種重組修飾之情況：出於改質植物中之合成澱粉目的之作物植物的重組修飾(例如 WO 92/11376，WO 92/14827，WO 91/19806)或具有經改質之脂肪酸組成的轉殖基因作物植物(WO 91/13972)的重組修飾。

藉由在植物播種之前及植物萌芽之前噴灑或撒布種子來進行活性化化合物之種子處理施用。

尤其適用於種子處理之組合物為(例如)：

A 可溶濃縮物(SL，LS)

D 乳液(EW、EO、ES)

E 懸浮液(SC、OD、FS)

F 水可分散之顆粒劑及水溶性顆粒劑(WG、SG)

G 水可分散之粉劑及水溶性粉劑(WP、SP、WS)

H 凝膠調配物(GF)

I 可撒布之粉劑(DP、DS)

習知之種子處理調配物包括(例如)可流動濃縮物FS、溶液LS、用於乾式處理之粉劑DS、用於漿液處理之水可分散之粉劑WS、水溶性粉劑SS及乳液ES及EC及凝膠調配物GF。該等調配物可在經稀釋或未經稀釋的情況下施用至種子。在播種前直接於種子上或在後者發芽後施用於種子。

在較佳實施例中，使用FS調配物處理種子。通常FS調配物可包含1 g/l-800 g/l之活性成份、1 g/l-200 g/l界面活性劑、0 g/l至200 g/l防凍劑、0 g/l至400 g/l黏合劑、0 g/l至200 g/l顏料及高達1公升之溶劑(較佳水)。

用於種子處理之尤其較佳的式I化合物的FS調配物包含0.1重量%至80重量%(1 g/l至800 g/l)之活性成份、0.1重量%至20重量%(1 g/l至200 g/l)之至少一種界面活性劑、例如0.05重量%至5重量%之濕潤劑及0.5重量%至15重量%之分散劑、高達20重量%，例如5%至20%之防凍劑、0重量%至15重量%，例如1重量%至15重量%之顏料及/或染料、0重量%至40重量%，例如1重量%至40重量%之黏合劑(黏結劑/黏著劑)、視情況高達5重量%，例如0.1重量%至5重量%之增稠劑、視情況0.1%至2%消泡劑，及視情況例如0.01重量%至1重量%之量的諸如殺生物劑之防腐劑、抗氧化劑等等，及高達100重量%之填料/媒劑。

種子處理調配物亦可另外包含黏合劑及視情況之著色劑。

可添加黏合劑以改良處理後種子上活性材料之黏著力。合適之黏合劑為嵌段共聚物EO/PO界面活性劑，以及聚乙醇醇、聚乙醇吡咯啉酮、聚丙烯酸酯、聚甲基丙烯酸酯、聚丁烯、聚異丁烯、聚苯乙烯、聚乙醇胺、聚乙醇醯胺、聚乙醇亞胺(Lupasol®， Polymin®)、聚醚、聚胺基甲酸酯、聚乙酸乙醇酯、甲基纖維素及衍生自該等聚合物之共聚物。

視情況，調配物中亦可包括著色劑。適用於種子處理調配物之著色劑或染料為若丹明(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 g 至 10 kg，較佳為每 100 公斤種子 1 g 至 5 kg，更佳為每 100 公斤種子 1 g 至 1000 g，且尤其每 100 公斤種子 1 g 至 200 g。

因此本發明亦係關於包含如本文所定義之式 I 化合物或 I 之農業上適用之鹽的種子。化合物 I 或其農業上適用之鹽的量一般在每 100 公斤種子 0.1 g 至 10 kg，較佳每 100 公斤種子 1 g 至 5 kg，尤其每 100 公斤種子 1 g 至 1000 g 內變化。對於諸如萵苣之特定作物而言，該施用率可更高。

【實施方式】

合成實例

以下表 C 中列舉根據以下合成實例所示之方案及藉由常規製備方法所獲得之代表本發明的化合物及其物理資料。

合成實例 1：

(4-氯-1,1-二側氧基-1H-1λ⁶-苯并[d]異噻唑-3-基)-異丁基-甲基-胺

(表 C 之第 22 號化合物)

中間物實例 1.1：3,4-二氯-苯并[d]異噻唑 1,1-二氧化物

將 6.53 g(30.0 mmol)4-氯糖精、5.4 g(45.0 mmol)亞硫醯氯及 0.3 ml 二甲基甲醯胺(DMF)添加至 30 ml 1,4-二噁烷中且加熱至回流歷時 48 h。將混合物冷卻至室溫且藉由蒸餾移除所有揮發物。獲得 5.3 g(22.5 mmol; 理論值之 75 %)標題化合物，且其未經進一步純化即用於下一步驟中。

第 22 號化合物實例：

(4-氯-1,1-二側氧基-1H-1 λ^6 -苯并[d]異噻唑-3-基)-異丁基-甲基-胺

將 472 mg(2.0 mmol)3,4-二氯-苯并[d]異噻唑 1,1-二氧化物溶解於 10 ml 無水四氫呋喃(THF)中且冷卻至 0°C。將 522 mg(6.0 mmol)N-甲基-異丁胺溶解於 10 ml 無水四氫呋喃(THF)中且緩慢添加。在此溫度下持續攪拌 1 h 且在室溫下攪拌 14 h。將混合物用二氯甲烷稀釋且藉由添加飽和氯化銨水溶液而中止。將層分離且將水層用二氯甲烷萃取三次。將組合之有機層用水洗滌，經硫酸鎂乾燥並濃縮。將乙酸乙酯添加至殘餘物中。將所得沉澱物藉由過濾收集，用乙酸乙酯洗滌且乾燥以得到 264 mg(0.02 mmol; 理論值之 46%)之熔點為 160°C-162°C 的標題化合物。

合成實例 2：

乙基-(4-甲氧基-1,1-二側氧基-1H-1 λ^6 -苯并[d]異噻唑-3-基)-甲基-胺

(表 C 之第 30 號化合物)

中間化合物 2.1：3-甲氧基-苯磺醯基氯

將 50.00 g(0.406 mol)之 3-甲氧基-苯胺添加至 120 ml 乙酸

中且冷卻至 5°C 至 10°C。在此溫度下將 30.81 g NaNO_2 溶解於 50 ml 水中並經 30 min 添加。

在第二燒瓶中，將 SO_2 鼓泡通過 230 ml 乙酸直至飽和。在維持反應溫度在 0°C-10°C 範圍內同時添加 20.20 g (0.150 mol) CuCl_2 並緩慢添加第一燒瓶之內含物。繼續攪拌直至無氣體析出。將混合物用二氯甲烷萃取三次。將組合之有機層用水洗滌，經硫酸鎂乾燥並濃縮以得到 66 g 作為粗產物之標題產物，其未經進一步純化即用於下一步驟中。

中間化合物 2.2：N-第三丁基-3-甲氧基磺醯胺

將 5.80 g (28.1 mmol) 3-甲氧基-苯磺醯基氯溶解於 100 ml 四氫呋喃 (THF) 中。添加 2.93 g (28.1 mmol) 第三丁基胺，隨後添加 5.89 g NaHCO_3 於 20 ml 水中之溶液。在室溫下繼續攪拌 14 h。將混合物濃縮且將剩餘混合物用乙酸乙酯萃取三次。將組合之有機層用水洗滌，經硫酸鎂乾燥並濃縮以得到 6.8 g 標題產物，其未經進一步純化即用於下一步驟中。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): δ [ppm]=1.22 (s, 9H), 3.86 (s, 3H), 5.18 (s, 1H), 7.07 (d 1H), 7.38 (t, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.51 (d, 1H)。

中間化合物 2.3：N-第三丁基-4-甲氧基-糖精

在惰性氣氛下將 20.0 g (82.2 mmol) N-第三丁基-3-甲氧基-磺醯胺溶解於 200 ml 無水四氫呋喃 (THF) 中並冷卻至 0°C。緩慢添加 130 ml (208 mmol) 1.6 M 正丁基鋰於己烷中之溶液。在此溫度下繼續攪拌 1 h 後使混合物冷卻至

(-78)°C。在此溫度下添加 15.5 g(164 mmol)氯甲酸甲酯並繼續攪拌 2 h。溫至室溫後，將混合物用甲基-第三丁基醚稀釋並藉由添加飽和氯化銨水溶液中止。將層分離，將有機層用鹽水洗滌，經硫酸鎂乾燥並濃縮。於二氧化矽上純化殘餘物(環己烷/乙酸乙酯 6:1)得到 14.0 g(52.0 mmol；理論值之 63 %)之標題化合物。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): δ [ppm]=1.78 (s, 9H), 4.04 (s, 3H), 7.22 (d, 1H), 7.39 (d 1H), 7.76 (t, 1H)。

中間化合物 2.4：4-甲氧基-糖精

將 5.60 g(20.8 mmol)N-第三丁基-4-甲氧基-糖精溶解於 20 g 三氟乙酸中並加熱至回流歷時 3 h。藉由蒸餾移除所有揮發物。將水添加至殘餘物中。將水層用乙酸乙酯萃取三次。將組合之有機層經硫酸鎂乾燥並濃縮。添加二氯甲烷直至開始形成沉澱物。將沉澱物藉由過濾收集並乾燥以得到 2.65 g 產物，其未經進一步純化即用於下一步驟中。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): δ [ppm]=4.07 (s, 3H), 7.27 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.83 (t, 1H)。

中間化合物 2.5：3-氯-4-甲氧基-苯并[d]異噻唑 1,1-二氧化物

將 1.80 g(8.44 mmol)4-甲氧基-糖精、1.51 g(12.66 mmol)亞硫醯氯及 0.15 g 二甲基甲醯胺(DMF)添加至 20 ml 1,4-二噁烷中並加熱至回流歷時 30 h。將混合物冷卻至室溫並藉由蒸餾移除所有揮發物。獲得 2.06 g 作為粗產物之標題化合物且其未經進一步純化即用於下一步驟中。

第30號化合物實例：

乙基-(4-甲氧基-1,1-二側氧基-1H-1 λ ⁶-苯并[d]異噻唑-3-基)-甲基-胺

在0℃下，將500 mg(2.16 mmol)3-氯-4-甲氧基-苯并[d]異噻唑1,1-二氧化物溶解於5 ml無水四氫呋喃(THF)中並緩慢添加至380 mg(6.47 mmol)乙基-甲基-胺之溶液中。在此溫度下繼續攪拌1 h且在室溫下攪拌14 h。將混合物用二氯甲烷稀釋並藉由添加飽和氯化銨水溶液中止。將層分離且將水層用二氯甲烷萃取兩次。將組合之有機層經硫酸鎂乾燥並濃縮。添加環己烷/乙酸乙酯2:1直至開始形成沉澱。將沉澱物藉由過濾收集且乾燥以得到209 mg(0.82 mmol；理論值之38 %)之標題化合物，其熔點為154℃-156℃。

合成實例3：

(4-二氟甲氧基-1,1-二側氧基-1H-1 λ ⁶-苯并[d]異噻唑-3-基)-二乙基-胺

(表C之第31號化合物)

中間化合物3.1：N-第三丁基-4-羥基-糖精

在惰性氣氛下將5.00 g(18.6 mmol)N-第三丁基-4-甲氧基-糖精溶解於50 ml二氯甲烷中並冷卻至(-78)℃。添加56.0 ml(56.0 mmol)BBr₃於二氯甲烷中之1 M溶液。在完成添加後，可藉由薄層層析法(TLC)觀察反應之完成。藉由仔細添加水中止反應。溫至室溫後，將層分離，且將有機層用水洗滌，經硫酸鎂乾燥並濃縮以得到3.50 g標題產物，其未經進一步純化即用於下一步驟中。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : δ [ppm]=1.76 (s, 9H), 7.19 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.65 (t, 1H), 9.22 (s, 1H)。

中間化合物 3.2 : N-第三丁基-4-二氟甲氧基-糖精

將 1.00 g (3.92 mmol) N-第三丁基-4-羥基-糖精及 1.79 g (12.9 mmol) 粉末化 K_2CO_3 添加至 20 ml 二甲基甲醯胺 (DMF) 中。將混合物加熱至 110°C 。將氯二氟甲烷通入混合物中歷時 5 min。濃縮混合物並將水及甲基-第三丁基醚添加至殘餘物中。將層分離，且將有機層用甲基-第三丁基醚萃取。將組合之有機層用 10% NaOH 水溶液洗滌並用水洗滌兩次，經硫酸鎂乾燥並濃縮以得到 1.20 g 標題化合物，其未經進一步純化即用於下一步驟中。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : δ [ppm]=1.78 (s, 9H), 6.80 (t, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.82 (t, 1H)。

中間化合物 3.3 : 4-二氟甲氧基-糖精

將 10.0 g (32.8 mmol) N-第三丁基-4-二氟甲氧基-糖精溶解於 50 ml 三氟乙酸中並加熱至回流歷時 30 h。在室溫下繼續攪拌 64 h。藉由蒸餾移除所有揮發物。將水添加至殘餘物中。將水層用乙酸乙酯萃取三次。將組合之有機層經硫酸鎂乾燥並濃縮以得到 9.5 g 粗產物，其未經進一步純化即用於下一步驟中。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : δ [ppm]=6.81 (t, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 8.01 (t, 1H)。

中間化合物 3.4 : 3-氯-4-二氟甲氧基-苯并[d]異噻唑 1,1-二氧化物

將 9.50 g (38.1 mmol) 4-二氟甲氧基-糖精、6.8 g (57.0 mmol) 亞硫醯氯及 0.4 ml 二甲基甲醯胺 (DMF) 添加至 50 ml 1,4-二噁烷中並加熱至回流歷時 29 h。將混合物冷卻至室溫並藉由蒸餾移除所有揮發物。獲得 9.3 g 作為粗產物之標題化合物，且其未經進一步純化即用於下一步驟中。

第 31 號化合物實例：

(4-二氟甲氧基-1,1-二側氧基-1H-1λ⁶-苯并[d]異噻唑-3-基)-二乙基-胺

將 500 mg (1.87 mmol) 3-氯-4-二氟甲氧基-苯并[d]異噻唑 1,1-二氧化物溶解於 15 ml 無水四氫呋喃 (THF) 中並冷卻至 0°C。緩慢添加 340 mg (4.65 mmol) 二乙胺。在此溫度下繼續攪拌 1 h，並於室溫下攪拌 48 h。將混合物用二氯甲烷稀釋並藉由添加飽和氯化銨水溶液中止。將層分離，且將水層用二氯甲烷萃取三次。將組合之有機層用水洗滌，經硫酸鎂乾燥並濃縮。於二氧化矽上純化殘餘物 (環己烷/乙酸乙酯 3:1) 得到 200 mg (0.66 mmol；理論值之 35 %) 之標題化合物，其熔點為 93°C-94°C。

合成實例 4：

(4-氯-苯并[d]異噻唑-3-基)-二丙基-胺

(表 C 之第 43 號化合物)

中間化合物 4.1：雙-(3-氯-2-氰基-苯基)-二硫化物

在室溫下將 7.0 g 2-氯-6-巰基-苯甲腈溶解於 25 ml 二甲亞砜中並攪拌 6 h。形成白色沉澱物並藉由過濾將其收集以在乾燥後得到 6.38 g (18.9 mmol；理論值之 92%) 標題化合物。

物。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : δ [ppm]=7.43 (d, 2H), 7.53 (t, 2H), 7.66 (d, 1H)。

第43號化合物實例：(4-氯-苯并[d]異噻唑-3-基)-二丙基-胺

將 2.00 g(5.93 mmol)雙-(3-氯-2-氯基-苯基)-二硫化物添加至 6.00 g(59.3 mmol)二-正丙基胺及 0.51 g(6.52 mmol)二甲亞碲於 2.4 ml 異丙醇中之溶液中。

將混合物加熱至回流歷時 24 h。將混合物冷卻至室溫並藉由蒸餾移除所有揮發物。將乙酸乙酯添加至殘餘物中。將濾液藉由過濾收集並濃縮。將殘餘物用乙腈/水作為溶離劑經 C-18 柱純化得到 0.63 g(2.34 mmol)呈油性物質之標題化合物。

合成實例 5：

(5-溴-4-甲氧基-苯并[d]異噻唑-3-基)-二甲基-胺

(表 C 之第 48 號化合物)

中間化合物 5.1：5-溴-4-甲氧基-1,2-苯并異噻唑-3-酮：

在 10°C 下將 3.1 g(23 mmol)硫醯氯添加至 5 g(19 mmol)5-溴-6-甲氧基-2-甲硫基-苯甲腈於 90 ml 氯苯中之溶液中。將溶液加熱至 70°C 並攪拌 2 h。在室溫下 12 h 後收集沉澱物並自甲苯中再結晶。

分離出 1.9 g(38%)之 5-溴-4-甲氧基-1,2-苯并異噻唑-3-酮：熔點 $197-198^\circ\text{C}$ 。

第 48 號化合物實例：

(5-溴-4-甲氧基-苯并[d]異噻唑-3-基)-二甲基-胺

將 1.7 g(5.7 mmol) 三 氟 甲 烷 磺 酸 酐 添 加 至 1 g(3.8 mmol)5- 溴 -4- 甲 氧 基 -1,2- 苯 并 異 噻 唑 -3- 酮 及 0.45 g(5.7 mmol)吡 啶 於 10 ml二 氯 甲 烷 中 之 溶 液 中 。 使 溫 度 保 持 於 35℃ 以 下 。 將 有 機 相 用 10% HCl水 溶 液 萃 取 ， 用 水 洗 滌 並 經 NaSO₄乾 燥 。

產 量 ： 1.31 g(87%)， ¹H-NMR (CDCl₃)： δ [ppm]=4.05 (s, 3H), 7.50 (d 1H), 7.75 (d,1H)。

向 0.5 g(1.3 mmol)三 氟 甲 磺 酸 鹽 於 5 ml THF中 之 溶 液 中 添 加 0.17 g(1.5 mmol)二 甲 胺 及 0.2 g(2 mmol)三 乙 胺 。 將 溶 液 於 室 溫 下 攪 拌 24 h。 將 混 合 物 傾 入 水 中 並 以 乙 酸 乙 酯 萃 取 。 將 有 機 相 用 碳 酸 鉀 溶 液 及 水 洗 滌 ， 經 NaSO₄乾 燥 ， 且 蒸 發 溶 劑 。 於 二 氧 化 矽 上 純 化 殘 餘 物 (環 己 烷 /乙 酸 乙 酯 6:1) 得 到 90 mg(25%)。 ¹H-NMR (CDCl₃)： δ [ppm]=3.08 (s, 6H), 3.91 (s, 3H), 7.39 (d 1H), 7.60 (d,1H)。

表 C：

產 物 係 由 耦 合 高 效 液 相 層 析 /質 譜 分 析 法 (HPLC/MS)， 由 NMR或 其 熔 點 來 加 以 表 徵 。

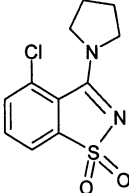
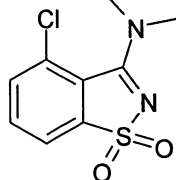
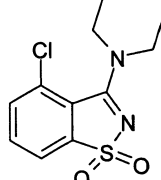
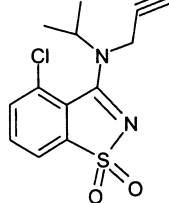
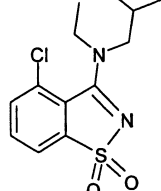
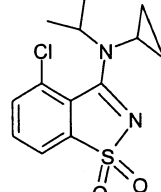
分 析 HPLC 柱 ： 來 自 Merck KgaA， Germany之 RP-18 柱 Chromolith Speed ROD。 溶 離 ： 40℃ 下 5分 鐘 內 比 率 為 5:95 至 95:5 之 乙 腈 +0.1% 三 氟 乙 酸 (TFA)/ 水 +0.1% 三 氟 乙 酸 (TFA)。

一 些 化 合 物 由 ¹H-NMR加 以 表 徵 。 由 對 比 四 甲 基 矽 烷 之 化 學 位 移 (ppm)、 其 多 重 度 及 其 積 分 (所 給 出 之 氫 原 子 的 相 對 數 目)來 表 徵 信 號 。 下 列 縮 寫 係 用 於 表 徵 信 號 之 多 重

度：M=多重峰，q=四重峰、t=三重峰、d=雙重峰且s=單峰。

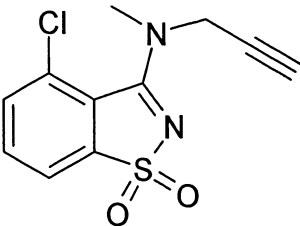
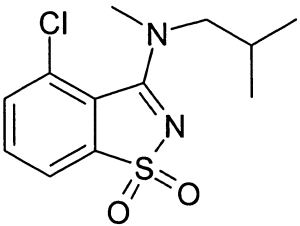
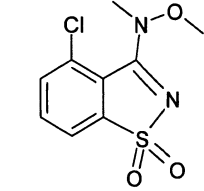
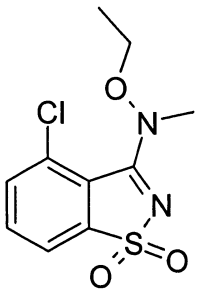
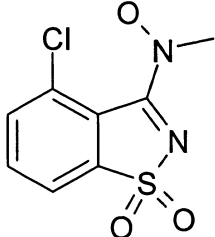
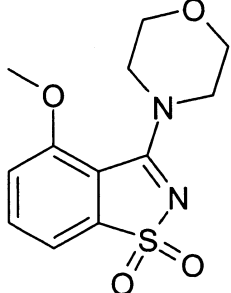
一些個別化合物由其熔點m.p.(°C)來表徵。

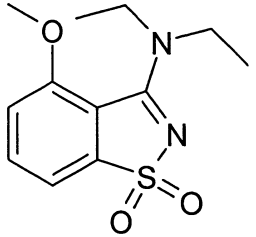
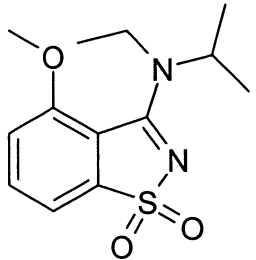
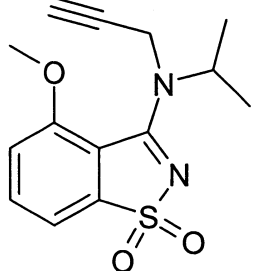
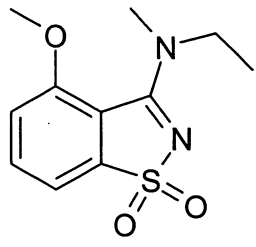
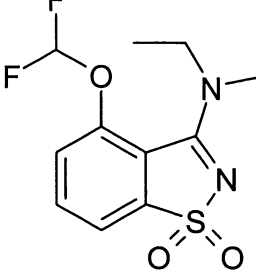
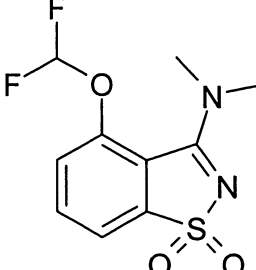
表 C

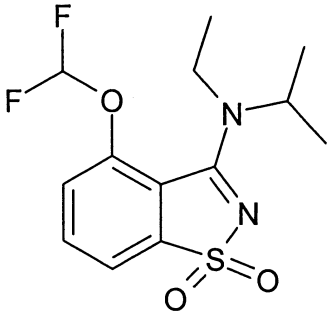
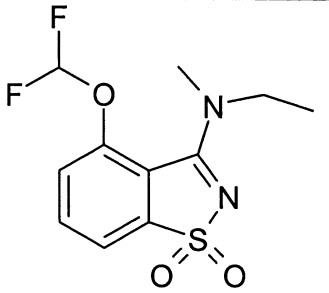
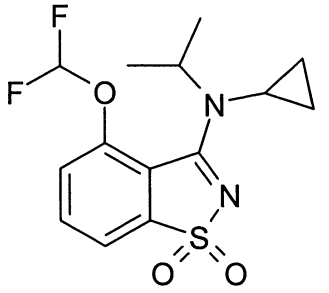
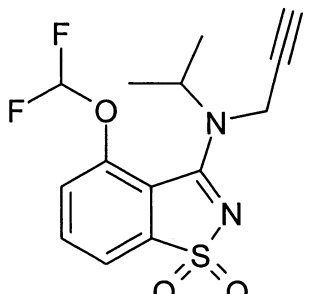
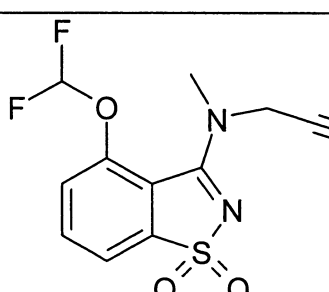
化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C]，滯留時間 t_r [min]，質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H - NMR))
1		HPLC-MS : t_r =2.24 min m/z =271 $[\text{M}+1]^+$
2		m.p.=179-180
3		m.p.=108-109
4		m.p.=122-124
5		m.p.=177-179
6		m.p.=106-108

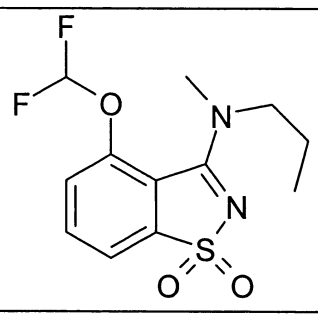
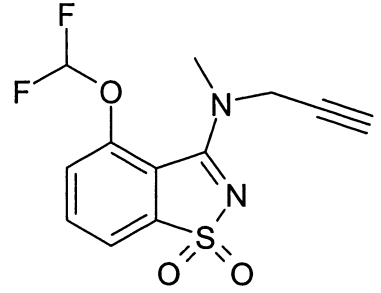
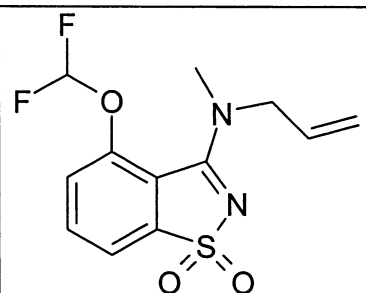
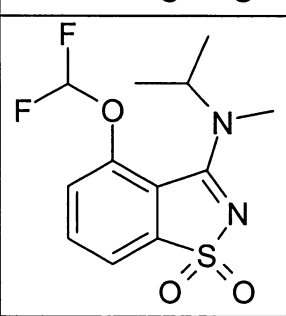
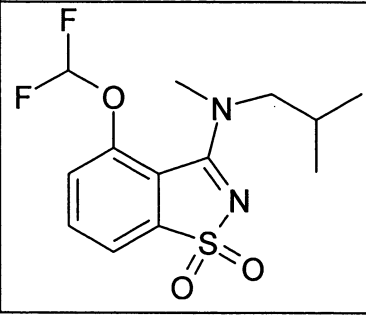
化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C], 滯留時間 t_r [min], 質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H -NMR))
7		m.p.=114-116
8		m.p.=95-97
9		m.p.=103-105
10		m.p.=101-103
11		^1H -NMR (CDCl_3) : 1.51 (d, 12H), 4.20 (m, 2H), 7.60 (m, 2H), 7.82 (t, 1H)
12		^1H -NMR (CDCl_3) : 1.28 (t, 3H), 3.58 (q, 2H), 4.85 (s, 2H), 7.31 (m, 5H), 7.65 (m, 2H), 7.79 (t, 1H).
13		m.p.=126-130

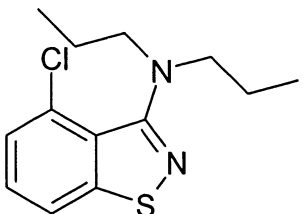
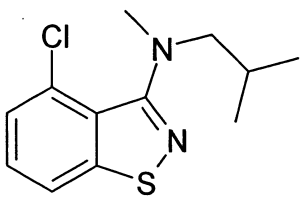
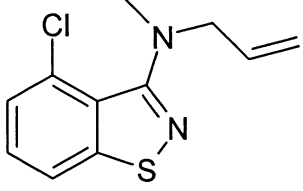
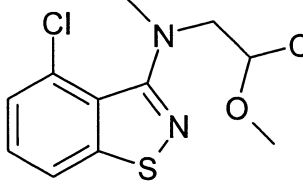
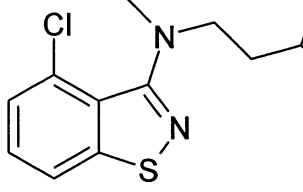
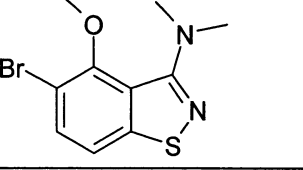
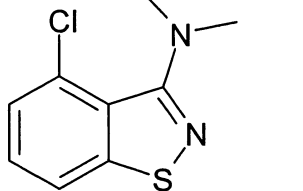
化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C], 滯留時間 t_r [min], 質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H - NMR))
14		m.p.=137-139
15		m.p.=156-162
16		m.p.=135-137
17		m.p.=142-144
18		m.p.=160-162
19		m.p.=82-84
20		m.p.=121-123

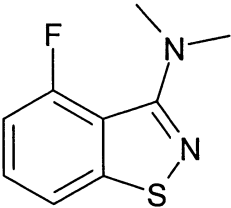
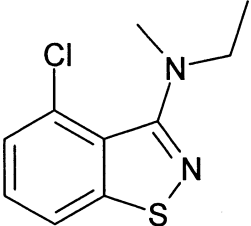
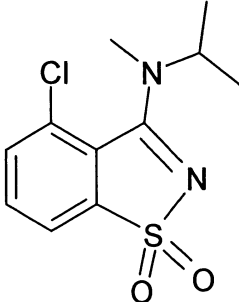
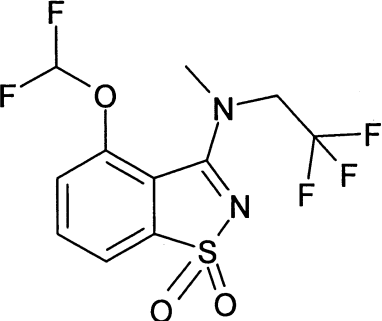
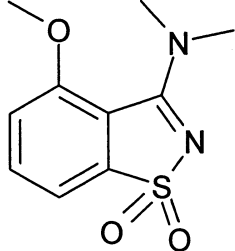
化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C]，滯留時間 t_r [min]，質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H - NMR))
21		m.p.=163-165
22		m.p.=160-162
23		m.p.=114-116
24		HPLC-MS : t_r =2,559 min m/z =275 $[\text{M}+1]^+$
25		m.p.=179-180
26		HPLC-MS : t_r = 1.79 min m/z =283 $[\text{M}+1]^+$

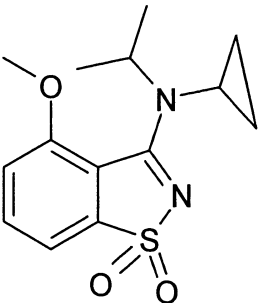
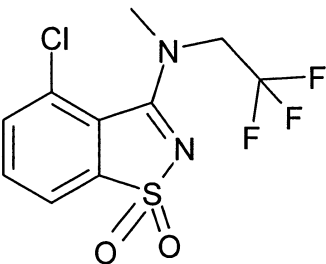
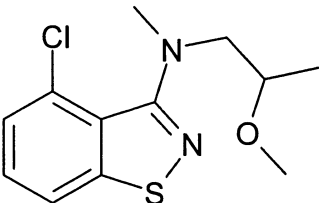
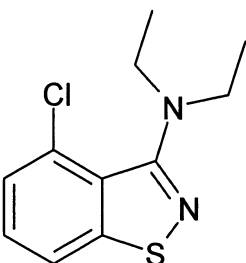
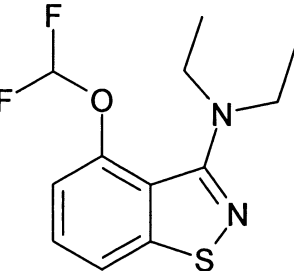
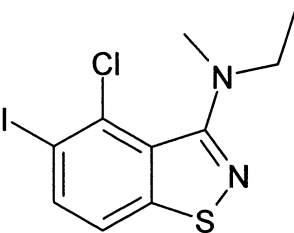
化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C]，滯留時間 t_r [min]，質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H - NMR))
27		m.p.=171-175
28		m.p.=113-114
29		HPLC-MS : t_r =2,539 min m/z=293 $[\text{M}+1]^+$
30		m.p.=154-156
31		m.p.=93-94
32		m.p.=149-151

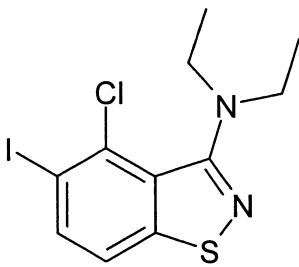
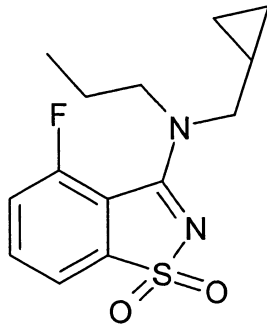
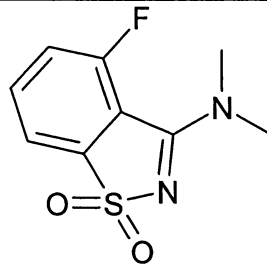
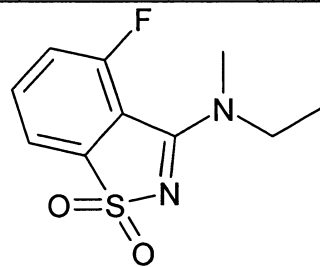
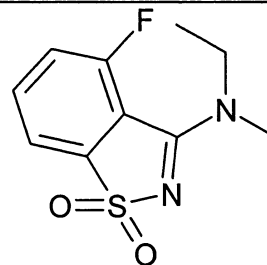
化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C]，滯留時間 t_r [min]，質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H - NMR))
33		HPLC-MS : t_r =2.80 min m/z =319 $[\text{M}+1]^+$
34		m.p.=108-109
35		m.p.=129-131
36		HPLC-MS : t_r =2.74 min m/z =329 $[\text{M}+1]^+$
37		HPLC-MS : t_r =2.09 min m/z =302 $[\text{M}+1]^+$

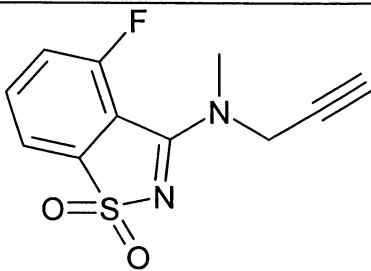
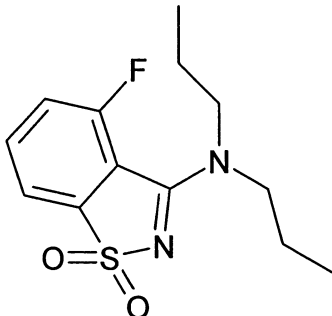
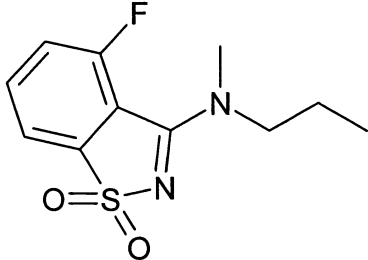
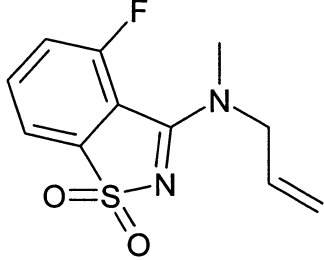
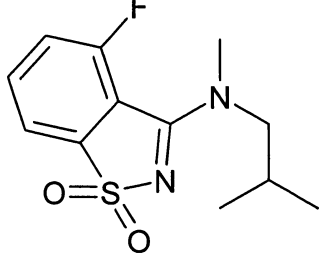
化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C]，滯留時間 t_r [min]，質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H -NMR))
38		m.p.=85-87
39		HPLC-MS : t_r =2.35 min m/z=301 [M+1] ⁺
40		m.p.=80-85
41		m.p.=87-93
42		HPLC-MS : t_r =2.87 min m/z=319 [M+1] ⁺

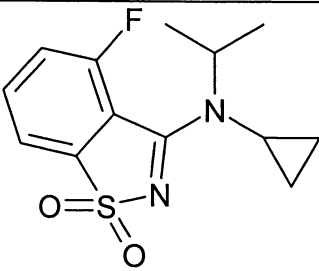
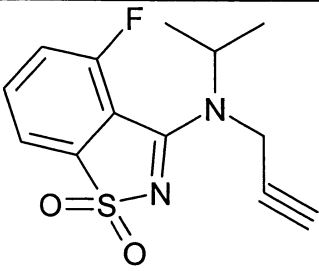
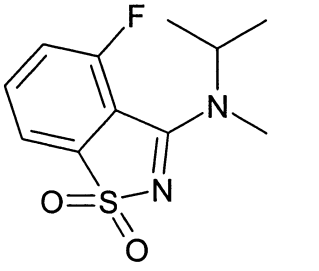
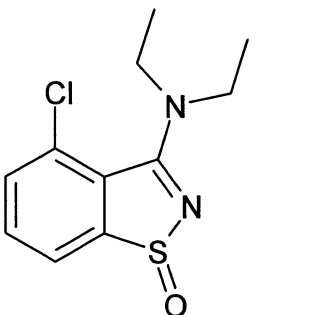
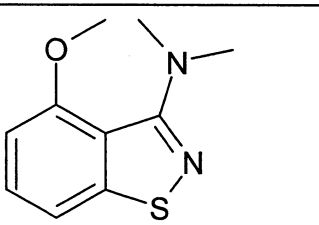
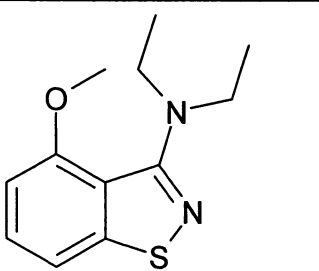
化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C]，滯留時間 t_r [min]，質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H -NMR))
43		HPLC-MS : t_r =4.37 min m/z =269 $[\text{M}+1]^+$
44		HPLC-MS : t_r =4.22 min m/z =255 $[\text{M}+1]^+$
45		HPLC-MS : t_r =4.08 min m/z =239 $[\text{M}+1]^+$
46		HPLC-MS : t_r =3.45 min m/z =287 $[\text{M}+1]$
47		HPLC-MS : t_r =3.53 min m/z =299 $[\text{M}+1]^+$
48		^1H -NMR (CDCl_3) : 3.08 (s, 6H), 3.91 (s, 3H), 7.39 (d 1H), 7.60 (d, 1H)
49		HPLC-MS : t_r =3.60 min m/z =213 $[\text{M}+1]$

化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C]，滯留時間 t_r [min]，質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H - NMR))
50		m.p.=145 - 146
51		^1H -NMR (CDCl_3) : 1.26 (t, 3H), 2.96 (s, 3H), 3.32 (q, 2H), 7.37 (m, 2H), 7.69 (m, 1H).
52		HPLC-MS : t_r =2.62 min m/z=273 [M+1]
53		HPLC-MS : t_r =2.83 min m/z=345 [M+1]
54		HPLC-MS : t_r =1.74 min m/z=241 [M+1]

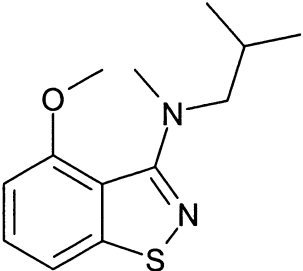
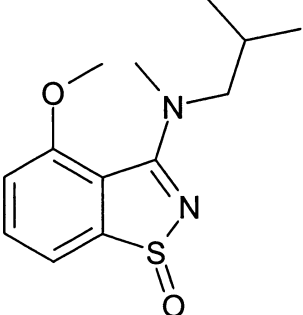
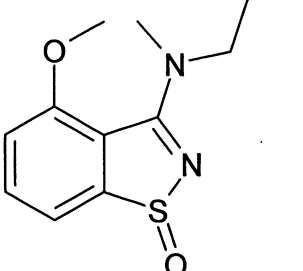
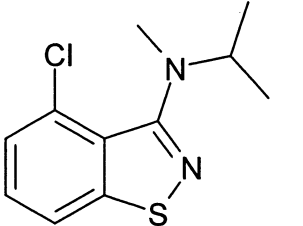
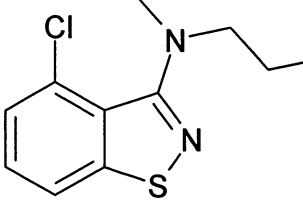
化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C], 滯留時間 t_r [min], 質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H -NMR))
55		HPLC-MS : t_r =2.72 min m/z =295 [M+1]
56		HPLC-MS : t_r =2.93 min m/z =313 [M+1]
57		HPLC-MS : t_r =3.74 min m/z =271 [M+1]
58		^1H -NMR (CDCl_3) : 1.17 (t, 6H), 3.39 (q, 4H), 7.34 (m, 2H), 7.69 (m, 1H).
59		m.p.=49 - 50
60		^1H -NMR (CDCl_3) : 1.21 (t, 3H), 2.94 (s, 3H), 3.30 (q, 2H), 7.42 (d, 1H), 7.90 (d, 1H).

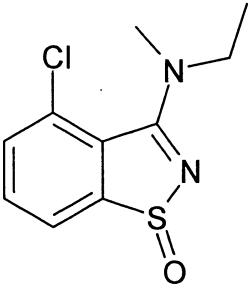
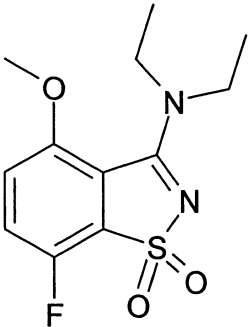
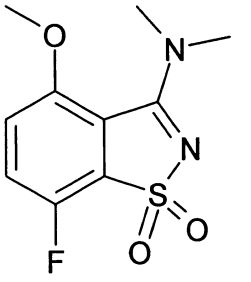
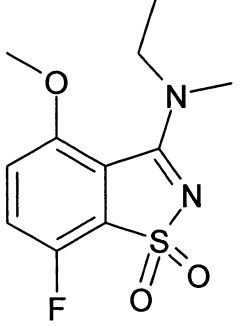
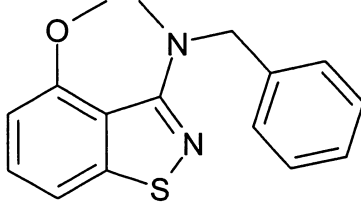
化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C] , 滯留時間 t_r [min] , 質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H -NMR))
61		^1H -NMR (CDCl_3) : 1.11 (t, 6H), 3.34 (q, 4H), 7.42 (d, 1H), 7.89 (d, 1H).
62		HPLC-MS : t_r =3.02 min m/z=297 [M+1]
63		HPLC-MS : t_r =1.66 min m/z=229 [M+1]
64		HPLC-MS : t_r =2.00 min m/z=243 [M+1]
65		HPLC-MS : t_r =2.33 min m/z=257 [M+1]

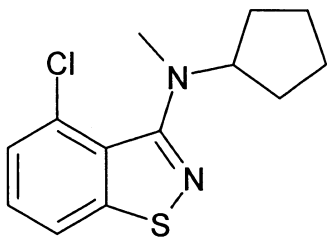
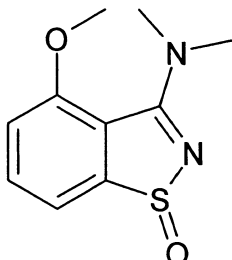
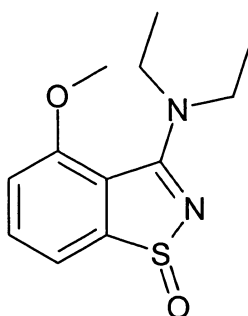
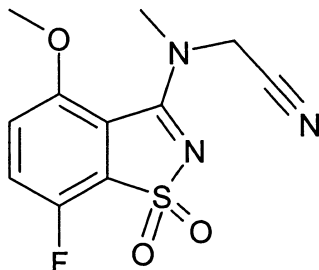
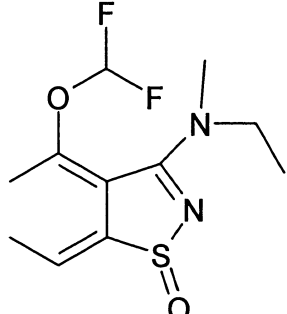
化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C]，滯留時間 t_r [min]，質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H -NMR))
66		HPLC-MS : t_r =2.07 min m/z =253 [M+1]
67		HPLC-MS : t_r =2.96 min m/z =285 [M+1]
68		HPLC-MS : t_r =2.36 min m/z =257 [M+1]
69		HPLC-MS : t_r = 2.25 min m/z =255 [M+1]
70		HPLC-MS : t_r =2.62 min m/z =271 [M+1]

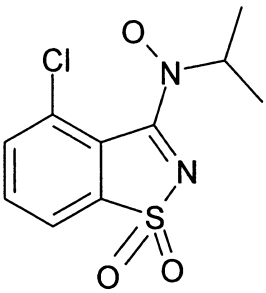
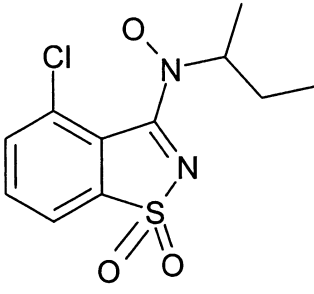
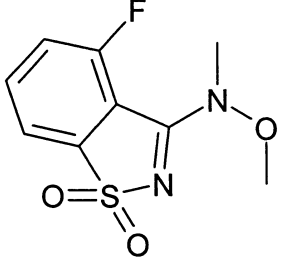
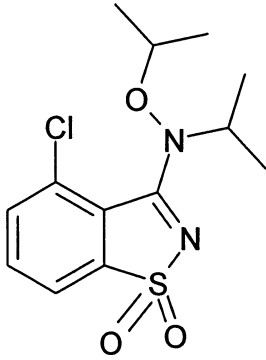
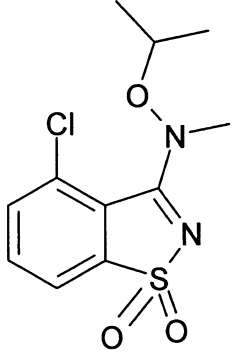
化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C]，滯留時間 t_r [min]，質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H -NMR))
71		HPLC-MS : t_r =2.71 min m/z=283 [M+1]
72		HPLC-MS : t_r =2.55 min m/z=281 [M+1]
73		HPLC-MS : t_r =2.04 min m/z=257 [M+1]
74		HPLC-MS : t_r =2.59 min m/z=257 [M+1]
75		^1H -NMR (CDCl_3) : 3.03 (s, 6H), 4.02 (s, 3H), 6.74 (d, 1H), 7.39 (m, 2H).
76		^1H -NMR (CDCl_3) : 1.20 (t, 6H), 3.42 (q, 4H), 3.98 (s, 3H), 6.70 (d, 1H), 7.34 (m, 2H).

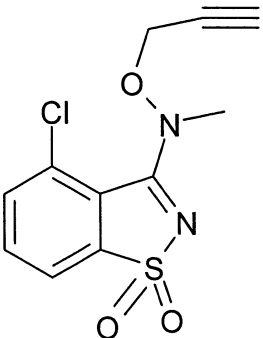
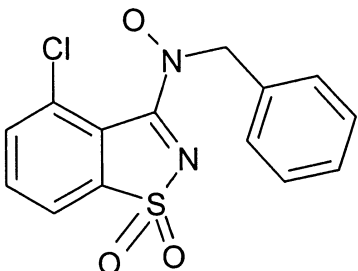
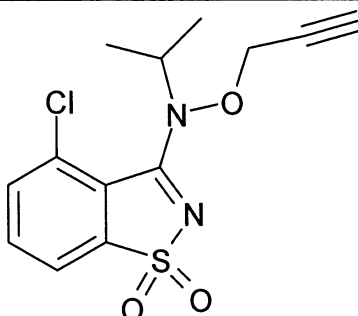
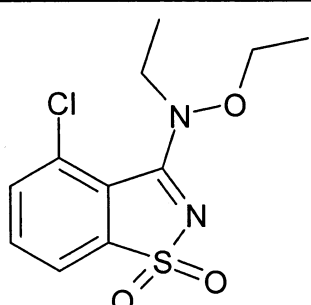
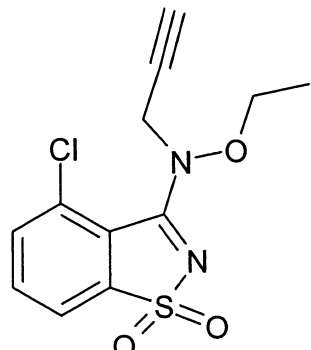
化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C] , 滯留時間 t_r [min] , 質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H -NMR))
77		^1H -NMR (CDCl_3) : 0.90 (d, 3H), 0.97 (d, 3H), 2.20 (m, 1H), 3.20 (s, 3H), 3.31 (q, 1H), 3.62 (q, 1H), 7.60 (m, 2H), 7.89 (m, 1H).
78		m.p.=147 - 148
79		^1H -NMR (CDCl_3) : 1.29 (t, 3H), 3.02 (s, 3H), 3.40 (q, 2H), 7.00 (m, 1H), 7.41 (m, 1H), 7.55 (m, 1H).
80		^1H -NMR (CDCl_3) : 1.22 (t, 3H), 2.99 (s, 3H), 3.39 (q, 2H), 6.67 (t, 1H), 7.07 (d, 1H), 7.46 (t, 1H), 7.65 (d, 1H).
81		HPLC-MS : t_r =2.53 min m/z=223 [$\text{M}+1$]
82		HPLC-MS : t_r =2.66 min m/z=237 [$\text{M}+1$]

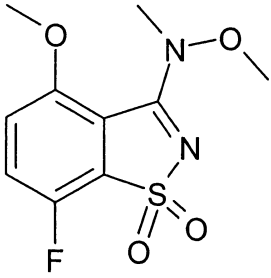
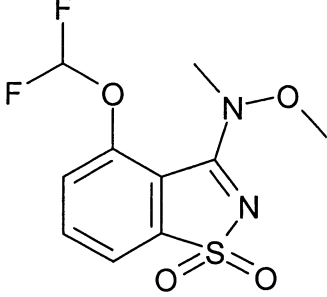
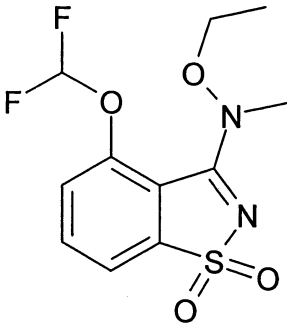
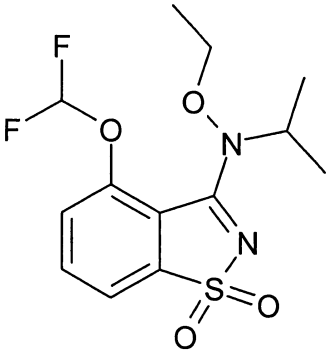
化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C], 滯留時間 t_r [min], 質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H - NMR))
83		HPLC-MS : t_r =3.52 min m/z =251 [M+1]
84		HPLC-MS : t_r =2.33 min m/z =267 [M+1]
85		HPLC-MS : t_r =1.83 min m/z =239 [M+1]
86		HPLC-MS : t_r =3.89 min m/z =241 [M+1]
87		HPLC-MS : t_r =3.99 min m/z =241 [M+1]

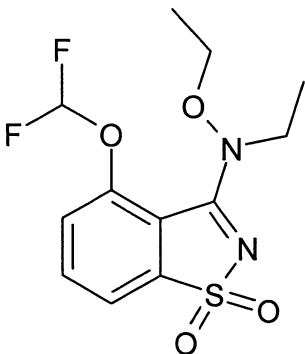
化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C], 滯留時間 t_r [min], 質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H - NMR))
88		HPLC-MS : t_r =2.16 min m/z =243 [M+1]
89		HPLC-MS : t_r = 2.52 min m/z =287 [M+1]
90		HPLC-MS : t_r = 1.96 min m/z =259 [M+1]
91		HPLC-MS : t_r = 2.18 min m/z =273 [M+1]
92		m.p.=53 - 55

化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C], 滯留時間 t_r [min], 質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H -NMR))
93		^1H -NMR (CDCl_3) : 1.59 (m, 2H), 1.70 (m, 4H), 1.91 (m, 2H), 2.89 (s, 3H), 4.08 (m, 1H), 7.35 (m, 2H), 7.69 (m, 1H).
94		HPLC-MS : t_r =1.60 min m/z=225 [M+1]
95		HPLC-MS : t_r =2.14 min m/z= 253 [M+1]
96		m.p.=128 - 130
97		HPLC-MS : t_r =2.29 min m/z=275 [M+1]

化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C], 滯留時間 t_r [min], 質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H -NMR))
98		^1H -NMR (CDCl_3) : 1.38 (d, 6H), 4.70 (m, 1H), 7.64 (m, 2H), 7.78 (m, 1H).
99		^1H -NMR (CDCl_3) : 0.92 (m, 3H), 1.40 (d, 3H), 1.65 (m, 1H), 1.94 (m, 1H), 4.45 (m, 1H), 7.65 (m, 2H), 7.78 (m, 1H).
100		HPLC-MS : t_r =1.88 min m/z=245 [M+1]
101		m.p.=130 - 131
102		m.p.=118 - 120

化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C]，滯留時間 t_r [min]，質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H - NMR))
103		m.p.=136 - 137
104		m.p.=167 - 169
105		m.p.=210 - 211
106		m.p.=80 - 81
107		m.p.=144 - 145

化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C] , 滯留時間 t_r [min] , 質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H - NMR))
108		m.p.=117-119
109		m.p= 104 - 105
110		HPLC-MS : t_r =2.41 min m/z=307 [M+1]
111		HPLC-MS : t_r =2.96 min m/z=335 [M+1]

化合物編號	式	物理性質(m.p. [°C], 滯留時間 t_r [min], 質譜m/z(HPLC/MS)或化學位移(^1H - NMR))
112		HPLC-MS : t_r =2.83 min m/z=321 [M+1]

式I之化合物抗害蟲之作用由下列實驗加以證明：

B.1 棉蚜 (棉蚜 (*aphis gossypii*))

將活性化合物於50:50丙酮:水及100 ppm Kinetic®界面活性劑中調配。

藉由將來自主要種群之受嚴重侵染的葉片置放於各子葉的頂部使子葉期之棉類植物侵染。使蚜蟲轉移至寄主植物隔夜，並移除用於轉移蚜蟲之葉片。將子葉浸入測試溶液中並使其乾燥。5天後計算死亡率。

在此測試中，300 ppm之化合物1-10、13-23、26-42、44-46、48、49、51-58、60-74、76-103及104-112相較於未經處理之對照組展示大於86%之死亡率。

B.2 綠桃蚜 (桃蚜 (*myzus persicae*))

將活性化合物於50:50丙酮:水及100 ppm Kinetic®界面活性劑中調配。

藉由將受侵染之葉片部分置放於測試植物頂部使第二對真葉期之胡椒植物("California Wonder"品種)受大致40隻實驗室培養之蚜蟲侵染。24小時後移除葉片部分。將完整植

物之葉片浸入測試化合物之梯度溶液中並使其乾燥。在約25℃及20%-40%之相對濕度下將測試植物保持於螢光燈下(24小時之光週期)。5天後測定相對於對照植物上之死亡率經處理之植物上之蚜蟲死亡率。

在此測試中，300 ppm之化合物2、3、6、7、15、19、23、27、28、30-34、36-42、48、49、51、53、57、58、62、64、73、74、76、78、80-83、85-89、91-98及108-112相較於未經處理之對照組展示大於86%之死亡率。

B.3.豆蚜(蠶豆蚜(*Aphis fabae*))

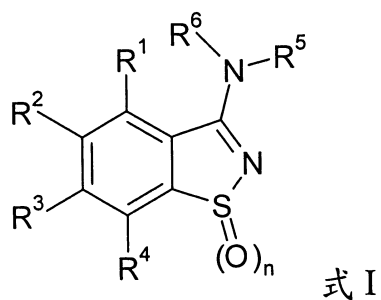
將活性化合物於50:50丙酮:水及100 ppm Kinetic®界面活性劑中調配。

藉由將受侵染之截斷植物(cut plant)置於測試植物之頂部，使第一對真葉期之生長於Metro混合物中之旱金蓮植物('Mixed Jewel'品種)受大致20-30隻實驗室培養之蚜蟲侵染。24小時後移除截斷植物。將各植物浸入測試溶液中以使葉、莖、凸出之種子表面及周圍立方表面完全覆蓋並使其於通風櫥中乾燥。將經處理之植物在連續螢光燈下保持於約25℃。3天後測定蚜蟲死亡率。

在此測試中，300 ppm之第3-9、11、12、15、23、36及49號化合物相較於未經處理之對照組展示大於86%之死亡率。

五、中文發明摘要：

本發明係關於一種利用式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物的殺蟲方法，



其中變數n及R¹至R⁶係如說明書中所定義。

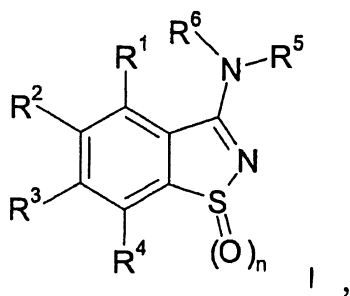
本發明係關於對抗或控制昆蟲、蛛形蟲或線蟲之方法，係關於保護生長中之植物免受昆蟲、蛛形蟲或線蟲攻擊或侵襲的方法，且係關於保護種子免受土壤昆蟲侵害及保護幼苗之根及芽免受土壤及食葉昆蟲侵害的方法。

六、英文發明摘要：

十、申請專利範圍：

1. 一種用於對抗或控制昆蟲、蛛形蟲或線蟲之方法，

其包含使昆蟲、蛛形蟲或線蟲或其食物來源、棲息地或繁殖場與殺蟲有效量之至少一種式I之3-胺基-1,2苯并異噻唑化合物或包含至少一種式I化合物的組合物接觸：



其中

n 為 0、1 或 2；

R¹ 為氫、硝基、氰基、疊氮基、胺基、鹵素、磺醯胺基、次磺醯胺基、亞磺醯胺基、C(=O)R^{1a}、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₈環烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆鹵烷氧基、C₁-C₆烷硫基、(C₁-C₆烷基)胺基、二(C₁-C₆烷基)胺基、C₁-C₆烷基亞磺醯基或C₁-C₆烷基磺醯基，其中該等最後提及之十一個基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由下列基團組成之群的基團：氰基、硝基、胺基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄烷基亞磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄鹵烷硫基、(C₁-C₄烷氧基)羰基、(C₁-C₄烷基)胺基、二(C₁-C₄烷基)胺基、C₃-C₈環烷基及苯基，苯

基可未經取代、經部分或完全鹵化及/或帶有1、2或3個彼此獨立地選自由下列基團組成之群的取代基：C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵烷基、C₁-C₄烷氧基及C₁-C₄鹵烷氧基，且其中

R^{1a} 係選自由下列基團組成之群：氫、羥基、C₁-C₆烷氧基、胺基、(C₁-C₆烷基)胺基、二(C₁-C₆烷基)胺基、C₁-C₆烷基、芳基、芳基-C₁-C₆烷基、3至7員雜芳基或雜芳基-C₁-C₄烷基，其中該雜芳基環含有作為環成員之1、2或3個選自由下列組成之群的雜原子：氮、氧、硫、基團SO、SO₂或N-Rⁿ，其中Rⁿ為氫、C₁-C₆烷基或(C₁-C₆烷基)-羰基；

R²、R³及R⁴係彼此獨立地選自由下列基團組成之群：氫、鹵素、氰基、疊氮基、硝基、C₁-C₆烷基、C₃-C₈環烷基、C₁-C₄鹵烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄烷基亞磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄鹵烷硫基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、(C₁-C₄烷氧基)羰基、胺基、(C₁-C₄烷基)胺基、二(C₁-C₄烷基)胺基、胺基羰基、(C₁-C₄烷基)胺基羰基、二(C₁-C₄烷基)胺基羰基、磺醯基、磺醯胺基、次磺醯胺基、硫基胺基及C(=O)-R^{2a}或C(=O)-R^{3a}或C(=O)-R^{4a}，且其中

R^{2a}或R^{3a}或R^{4a}係選自由下列基團組成之群：氫、羥基、C₁-C₆烷氧基、胺基、C₁-C₆烷基、芳基、

芳基-C₁-C₆烷基、(C₁-C₆烷基)-胺基、二(C₁-C₆烷基)-胺基、3至7員雜芳基或雜芳基-C₁-C₄烷基，其中該雜芳基環含有作為環成員之1、2或3個選自由下列組成之群的雜原子：氮、氧、硫、基團SO、SO₂或N-Rⁿ，其中Rⁿ為氫、C₁-C₆烷基或(C₁-C₆烷基)-羰基；

R⁵ 係選自由下列基團組成之群：OR^{5a}、C₁-C₁₀烷基、C₂-C₁₀烯基、C₂-C₁₀炔基、C₃-C₁₀環烷基，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1-4個選自由下列基團組成之群的基團：C₁-C₁₀烷氧基、C₁-C₁₀烷硫基、C₁-C₁₀烷基亞磺基、C₁-C₁₀烷基磺基、C₁-C₁₀鹵烷氧基、C₁-C₁₀鹵烷硫基、(C₁-C₁₀烷氧基)羰基、氰基、硝基、胺基、(C₁-C₁₀烷基)胺基、二-(C₁-C₁₀烷基)胺基、C₃-C₁₀環烷基及苯基，苯基可未經取代、經部分或完全鹵化及/或帶有1-3個選自由下列基團組成之群的取代基：C₁-C₆烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆鹵烷氧基，且其中

R^{5a} 係選自氫、C₁-C₁₀烷基、C₁-C₁₀鹼基、C₃-C₁₀環烷基、C₂-C₁₀烯基、C₂-C₁₀炔基、芳基、芳基-C₁-C₄烷基、雜芳基及雜芳基-C₁-C₄烷基、雜環基或雜環基-C₁-C₄烷基，且其中該等基團之碳原子可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由下列基團組成之群的基

團：氰基、硝基、胺基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺基、 C_1 - C_4 烷基磺基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、(C_1 - C_4 烷氧基)羰基、(C_1 - C_4 烷基)胺基、二(C_1 - C_4 烷基)胺基及 C_3 - C_8 環烷基；

R^6 係選自由下列基團組成之群： C_1 - C_{10} 烷基、 C_2 - C_{10} 烯基、 C_2 - C_{10} 炔基、 C_3 - C_{10} 環烷基，其中該等最後提及之四個基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1-4個選自由下列基團組成之群的基團： C_1 - C_{10} 烷氧基、 C_1 - C_{10} 烷硫基、 C_1 - C_{10} 烷基亞磺基、 C_1 - C_{10} 烷基磺基、 C_1 - C_{10} 鹵烷氧基、 C_1 - C_{10} 鹵烷硫基、(C_1 - C_{10} 烷氧基)羰基、氰基、硝基、胺基、(C_1 - C_{10} 烷基)胺基、二-(C_1 - C_{10} 烷基)胺基、 C_3 - C_{10} 環烷基及苯基，苯基可未經取代、經部分或完全鹵化及/或帶有1-3個選自由下列基團組成之群的取代基： C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_1 - C_6 烷氧基及 C_1 - C_6 鹵烷氧基，或

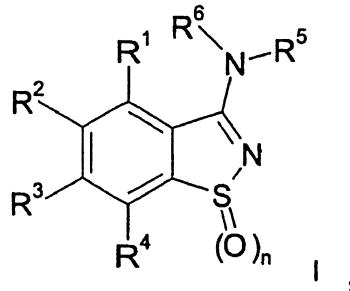
R^5/R^{5a} 及 R^6 可接合以形成3-10員環，其視情況經取代且除視情況經取代之 C_1 - C_5 烷基以外，還視情況獨立地含有1至3個N、 NR^n 、O、S、SO、 SO_2 部分，其可視情況不飽和，且其中

R^n 為氫、 C_1 - C_6 烷基或(C_1 - C_6 烷基)-羰基；

或其對映異構物或非對映異構物、鹽或酯。

2. 一種用於保護生長中之植物免受昆蟲、蛛形蟲或線蟲攻

擊或侵襲的方法，其包含使植物或植物所生長之土壤或水與殺蟲有效量之至少一種式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含至少一種式I化合物的組合物接觸：



其中

n 為 0、1 或 2；

R¹ 為氫、硝基、氰基、疊氮基、胺基、鹵素、磺醯胺基、次磺醯胺基、亞磺醯胺基、C(=O)R^{1a}、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₈環烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆鹵烷氧基、C₁-C₆烷硫基、(C₁-C₆烷基)胺基、二(C₁-C₆烷基)胺基、C₁-C₆烷基亞磺醯基或C₁-C₆烷基磺醯基，其中該等最後提及之十一個基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由下列基團組成之群的基團：氰基、硝基、胺基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄烷基亞磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄鹵烷硫基、(C₁-C₄烷氧基)羰基、(C₁-C₄烷基)胺基、二(C₁-C₄烷基)胺基、C₃-C₈環烷基及苯基，苯基可未經取代、經部分或完全鹵化及/或帶有1、2或3個彼此獨立地選自由下列基團組成之群的取代

基：C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵烷基、C₁-C₄烷氧基及C₁-C₄鹵烷氧基，且其中

R^{1a} 係選自由下列基團組成之群：氫、羥基、C₁-C₆烷氧基、胺基、(C₁-C₆烷基)-胺基、二(C₁-C₆烷基)胺基、C₁-C₆烷基、芳基、芳基-C₁-C₆烷基、3至7員雜芳基或雜芳基-C₁-C₄烷基，其中該雜芳基環含有作為環成員之1、2或3個選自由下列組成之群的雜原子：氮、氧、硫、基團SO、SO₂或N-Rⁿ，其中Rⁿ為氫、C₁-C₆烷基或(C₁-C₆烷基)-羰基；

R²、R³及R⁴係彼此獨立地選自由下列基團組成之群：氫、鹵素、氰基、疊氮基、硝基、C₁-C₆烷基、C₃-C₈環烷基、C₁-C₄鹵烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄烷基亞磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄鹵烷硫基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、(C₁-C₄烷氧基)羰基、胺基、(C₁-C₄烷基)胺基、二(C₁-C₄烷基)胺基、胺基羰基、(C₁-C₄烷基)胺基羰基、二(C₁-C₄烷基)胺基羰基、磺醯基、磺醯胺基、次磺醯胺基、硫基胺基及C(=O)-R^{2a}或C(=O)-R^{3a}或C(=O)-R^{4a}，且其中

R^{2a}或R^{3a}或R^{4a}係選自由下列基團組成之群：氫、羥基、C₁-C₆烷氧基、胺基、C₁-C₆烷基、芳基、芳基-C₁-C₆烷基、(C₁-C₆烷基)-胺基、二(C₁-C₆烷基)-胺基、3至7員雜芳基或雜芳基-C₁-C₄烷

基，其中該雜芳基環含有作為環成員之1、2或3個選自由下列組成之群的雜原子：氮、氧、硫、基團SO、SO₂或NRⁿ，其中Rⁿ為氫、C₁-C₆烷基或(C₁-C₆烷基)-羰基；

R⁵ 係選自由下列基團組成之群：OR^{5a}、C₁-C₁₀烷基、C₂-C₁₀烯基、C₂-C₁₀炔基、C₃-C₁₀環烷基，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1-4個選自由下列基團組成之群的基團：C₁-C₁₀烷氧基、C₁-C₁₀烷硫基、C₁-C₁₀烷基亞磺基、C₁-C₁₀烷基磺基、C₁-C₁₀鹵烷氧基、C₁-C₁₀鹵烷硫基、(C₁-C₁₀烷氧基)羰基、氰基、硝基、胺基、(C₁-C₁₀烷基)胺基、二-(C₁-C₁₀烷基)胺基、C₃-C₁₀環烷基及苯基，苯基可未經取代、經部分或完全鹵化及/或帶有1-3個選自由下列基團組成之群的取代基：C₁-C₆烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆鹵烷氧基，且其中

R^{5a} 係選自氫、C₁-C₁₀烷基、C₁-C₁₀磺基、C₃-C₁₀環烷基、C₂-C₁₀烯基、C₂-C₁₀炔基、芳基、芳基-C₁-C₄烷基、雜芳基及雜芳基-C₁-C₄烷基、雜環基或雜環基-C₁-C₄烷基，且其中該等基團之碳原子可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由下列基團組成之群的基團：氰基、硝基、胺基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄烷基亞磺基、C₁-C₄烷基磺基

基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷硫基、 $(C_1-C_4$ 烷氧基)羰基、 $(C_1-C_4$ 烷基)胺基、二 $(C_1-C_4$ 烷基)胺基及 C_3-C_8 環烷基；

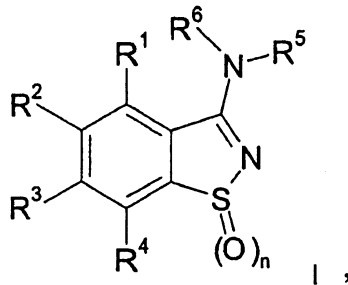
R^6 係選自由下列基團組成之群： C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_3-C_{10} 環烷基，其中該等最後提及之四個基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有 1-4 個選自由下列基團組成之群的基團： C_1-C_{10} 烷氧基、 C_1-C_{10} 烷硫基、 C_1-C_{10} 烷基亞磺基、 C_1-C_{10} 烷基磺基、 C_1-C_{10} 鹵烷氧基、 C_1-C_{10} 鹵烷硫基、 $(C_1-C_{10}$ 烷氧基)羰基、氰基、硝基、胺基、 $(C_1-C_{10}$ 烷基)胺基、二- $(C_1-C_{10}$ 烷基)胺基、 C_3-C_{10} 環烷基及苯基，苯基可未經取代、經部分或完全鹵化及/或帶有 1-3 個選自由下列基團組成之群的取代基： C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_1-C_6 烷氧基及 C_1-C_6 鹵烷氧基，或

R^5/R^{5a} 與 R^6 可接合以形成 3-10 員環，其視情況經取代且除視情況經取代之 C_1-C_5 烷基以外，還視情況獨立地含有 1 至 3 個 NR^n 、O、S、SO、 SO_2 部分，其可視情況不飽和，且其中 R^n 為氫、 C_1-C_6 烷基或 $(C_1-C_6$ 烷基)-羰基；

或其對映異構物或非對映異構物、鹽或酯。

3. 一種用於保護種子免受土壤昆蟲侵害及保護幼苗之根及芽免受土壤及食葉昆蟲侵害的方法，其包含在播種前及/或發芽處理後使該等種子與至少一種式 I 之 3-胺基-1,2-苯

并異噻唑化合物或包含至少一種式I化合物的組合物接觸：



其中

n 為 0、1 或 2；

R^1 為氫、硝基、氰基、疊氮基、胺基、鹵素、磺醯胺基、次磺醯胺基、亞磺醯胺基、 $C(=O)R^{1a}$ 、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_8 環烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 $(C_1-C_6$ 烷基)胺基、二 $(C_1-C_6$ 烷基)胺基、 C_1-C_6 烷基亞磺醯基或 C_1-C_6 烷基磺醯基，其中該等最後提及之十一個基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由下列基團組成之群的基團：氰基、硝基、胺基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亞磺醯基、 C_1-C_4 烷基磺醯基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷硫基、 $(C_1-C_4$ 烷氧基)羰基、 $(C_1-C_4$ 烷基)胺基、二 $(C_1-C_4$ 烷基)胺基、 C_3-C_8 環烷基及苯基，苯基可未經取代、經部分或完全鹵化及/或帶有1、2或3個彼此獨立地選自由下列基團組成之群的取代基： C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_1-C_4 烷氧基及 C_1-

C₄鹵烷氧基，且其中

R^{1a} 係選自由下列基團組成之群：氫、羥基、C₁-C₆烷氧基、胺基、(C₁-C₆烷基)胺基、二(C₁-C₆烷基)胺基、C₁-C₆烷基、芳基、芳基-C₁-C₆烷基、3至7員雜芳基或雜芳基-C₁-C₄烷基，其中該雜芳基環含有作為環成員之1、2或3個選自由下列組成之群的雜原子：氮、氧、硫、基團SO、SO₂或N-Rⁿ，其中Rⁿ為氫、C₁-C₆烷基或(C₁-C₆烷基)-羰基；

R²、R³及R⁴係彼此獨立地選自由下列基團組成之群：氫、鹵素、氰基、疊氮基、硝基、C₁-C₆烷基、C₃-C₈環烷基、C₁-C₄鹵烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄烷基亞磺基、C₁-C₄烷基磺基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄鹵烷硫基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、(C₁-C₄烷氧基)羰基、胺基、(C₁-C₄烷基)胺基、二(C₁-C₄烷基)胺基、胺基羰基、(C₁-C₄烷基)胺基羰基、二(C₁-C₄烷基)胺基羰基、磺基、磺基胺基、次磺基胺基、硫基胺基及C(=O)-R^{2a}或C(=O)-R^{3a}或C(=O)-R^{4a}，且其中

R^{2a}或R^{3a}或R^{4a}係選自由下列基團組成之群：氫、羥基、C₁-C₆烷氧基、胺基、C₁-C₆烷基、芳基、芳基-C₁-C₆烷基、(C₁-C₆烷基)-胺基、二-(C₁-C₆烷基)-胺基、3至7員雜芳基或雜芳基-C₁-C₄烷基，其中該雜芳基環含有作為環成員之1、2或3個選自由下列組

成之群的雜原子：氮、氧、硫、基團 SO 、 SO_2 或 NR^n ，其中 R^n 為氫、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基或 $(\text{C}_1\text{-C}_6 \text{ 烷基})\text{-羰基}$ ；

R^5 係選自由下列基團組成之群： OR^{5a} 、 $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ 烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ 烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ 炔基、 $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ 環烷基，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有 1-4 個選自由下列基團組成之群的基團： $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ 烷硫基、 $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ 烷基亞磺醯基、 $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ 烷基磺醯基、 $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ 鹵烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ 鹵烷硫基、 $(\text{C}_1\text{-C}_{10} \text{ 烷氧基})\text{-羰基}$ 、氰基、硝基、胺基、 $(\text{C}_1\text{-C}_{10} \text{ 烷基})\text{-胺基}$ 、二- $(\text{C}_1\text{-C}_{10} \text{ 烷基})\text{-胺基}$ 、 $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ 環烷基及苯基，苯基可未經取代、經部分或完全鹵化及/或帶有 1-3 個選自由下列基團組成之群的取代基： $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 鹵烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 鹵烷氧基，且其中

R^{5a} 係選自氫、 $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ 醯基、 $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ 環烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ 烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ 炔基、芳基、芳基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、雜芳基及雜芳基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、雜環基或雜環基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基，且其中該等基團之碳原子可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有 1、2 或 3 個選自由下列基團組成之群的基團：氰基、硝基、胺基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷硫基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基亞磺醯基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基磺醯基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷硫基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4$

烷氧基)羰基、(C₁-C₄烷基)胺基、二(C₁-C₄烷基)胺基及C₃-C₈環烷基；

R⁶ 係選自由下列基團組成之群：C₁-C₁₀烷基、C₂-C₁₀烯基、C₂-C₁₀炔基、C₃-C₁₀環烷基，其中該等最後提及之四個基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1-4個選自由下列基團組成之群的基團：C₁-C₁₀烷氧基、C₁-C₁₀烷硫基、C₁-C₁₀烷基亞磺基、C₁-C₁₀烷基磺基、C₁-C₁₀鹵烷氧基、C₁-C₁₀鹵烷硫基、(C₁-C₁₀烷氧基)羰基、氰基、硝基、胺基、(C₁-C₁₀烷基)胺基、二-(C₁-C₁₀烷基)胺基、C₃-C₁₀環烷基及苯基，苯基可未經取代、經部分或完全鹵化及/或帶有1-3個選自由下列基團組成之群的取代基：C₁-C₆烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₁-C₆烷氧基及C₁-C₆鹵烷氧基，或

R⁵/R^{5a}與R⁶可接合以形成3-10員環，其視情況經取代且除視情況經取代之C₁-C₅烷基以外，還視情況獨立地含有1至3個N、NRⁿ、O、S、SO、SO₂部分，其可視情況不飽和，且其中

Rⁿ 為氫、C₁-C₆烷基或(C₁-C₆烷基)-羰基；

或其對映異構物或非對映異構物、鹽或酯。

4. 如請求項1之以殺蟲有效量的式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之組合物來控制昆蟲、蛛形蟲或線蟲的方法，其中n為2。

5. 如請求項1之以殺蟲有效量的式I之3-胺基-1,2-苯并異噻

唑化合物或包含其之組合物來控制昆蟲、蛛形蟲或線蟲的方法，其中n為0。

6. 如請求項1之以殺蟲有效量的式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之組合物來控制昆蟲、蛛形蟲或線蟲的方法，其中

R^1 為鹵素、 $C(=O)R^{1a}$ 、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_8 環烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由下列基團組成之群的基團： C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、(C_1-C_4 烷氧基)羰基及 C_3-C_8 環烷基，且其中

R^{1a} 係選自由下列基團組成之群：氫、羥基、 C_1-C_6 烷氧基、胺基、(C_1-C_6 烷基)胺基、二(C_1-C_6 烷基)胺基、 C_1-C_6 烷基、芳基及芳基- C_1-C_6 烷基。

7. 如請求項1之以殺蟲有效量的式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之組合物來控制昆蟲、蛛形蟲或線蟲的方法，其中

R^1 為鹵素、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由 C_1-C_4 烷氧基及 C_1-C_4 鹵烷氧基組成之群的基團。

8. 如請求項2之以殺蟲有效量的式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之組合物來保護生長中之植物免受昆

蟲、蛛形蟲或線蟲攻擊或侵襲的方法，其中n為2。

9. 如請求項2之以殺蟲有效量的式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之組合物來保護生長中之植物免受昆蟲、蛛形蟲或線蟲攻擊或侵襲的方法，其中n為0。

10. 如請求項2之以殺蟲有效量的式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之組合物來保護生長中之植物免受昆蟲、蛛形蟲或線蟲攻擊或侵襲的方法，其中

R^1 為鹵素、 $C(=O)R^{1a}$ 、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_8 環烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由下列基團組成之群的基團： C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、(C_1-C_4 烷氧基)羰基及 C_3-C_8 環烷基，且其中

R^{1a} 係選自由下列基團組成之群：氫、羥基、 C_1-C_6 烷氧基、胺基、(C_1-C_6 烷基)胺基、二(C_1-C_6 烷基)胺基、 C_1-C_6 烷基、芳基及芳基- C_1-C_6 烷基。

11. 如請求項2之以殺蟲有效量的式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之組合物來保護生長中之植物免受昆蟲、蛛形蟲或線蟲攻擊或侵襲的方法，其中

R^1 為鹵素、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由 C_1-C_4 烷氧基及 C_1-C_4 鹵烷氧基組成之群的基團。

12. 如請求項3之包含在播種前及/或發芽處理後使種子與殺蟲有效量的式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之組合物接觸的用於保護該等種子免受土壤昆蟲侵害及保護幼苗之根及芽免受土壤及食葉昆蟲侵害的方法，其中n為2。

13. 如請求項3之包含在播種前及/或發芽處理後使種子與殺蟲有效量的式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之組合物接觸的用於保護該等種子免受土壤昆蟲侵害及保護幼苗之根及芽免受土壤及食葉昆蟲侵害的方法，其中n為0。

14. 如請求項3之包含在播種前及/或發芽處理後使種子與殺蟲有效量的式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之組合物接觸的用於保護該等種子免受土壤昆蟲侵害及保護幼苗之根及芽免受土壤及食葉昆蟲侵害的方法，其中

R^1 為鹵素、 $C(=O)R^{1a}$ 、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_8 環烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由下列基團組成之群的基團： C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 $(C_1-C_4$ 烷氧基)羰基及 C_3-C_8 環烷基，且其中

R^{1a} 係選自由下列基團組成之群：氫、羥基、 C_1-C_6 烷氧基、胺基、 $(C_1-C_6$ 烷基)胺基、二 $(C_1-C_6$ 烷基)胺基、 C_1-C_6 烷基、芳基及芳基- C_1-C_6 烷

基。

15. 如請求項3之包含在播種前及/或發芽處理後使種子與殺蟲有效量的式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之組合物接觸的用於保護該等種子免受土壤昆蟲侵害及保護幼苗之根及芽免受土壤及食葉昆蟲侵害的方法，其中

R^1 為鹵素、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由 C_1 - C_4 烷氧基及 C_1 - C_4 鹵烷氧基組成之群的基團。

16. 如請求項1、2或3之方法，其中該等動物害蟲為昆蟲、蛛形蟲或線蟲。

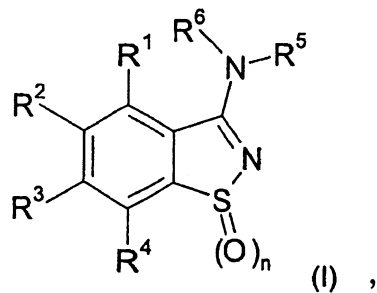
17. 如請求項3之方法，其中如請求項3或12至15中任一項之式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物係以每100 kg種子0.1 g至10 kg之量施用。

18. 如請求項17之方法，其中該所得植物之根及芽受到保護。

19. 如請求項17或18之方法，其中該所得植物之芽受到保護而免受蚜蟲侵害。

20. 一種種子，其包含每100 kg種子0.1 g至10 kg之量的如請求項3或請求項12至15中任一項之式I的3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或I之農業上適用之鹽。

21. 一種式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物，



其中

n 為 0、1 或 2；

R^1 為硝基、氰基、疊氮基、胺基、鹵素、磺醯胺基、次磺醯胺基、亞磺醯胺基、 $C(=O)R^{1a}$ 、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_8 環烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、(C_1 - C_6 烷基)胺基、二(C_1 - C_6 烷基)胺基、 C_1 - C_6 烷基亞磺醯基或 C_1 - C_6 烷基磺醯基，其中該等最後提及之十一個基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有 1、2 或 3 個選自由下列基團組成之群之基團：氰基、硝基、胺基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 -烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 -烷基磺醯基、 C_1 - C_4 -鹵烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、(C_1 - C_4 烷氧基)羰基、(C_1 - C_4 烷基)胺基、二(C_1 - C_4 烷基)胺基、 C_3 - C_8 環烷基及苯基，苯基可未經取代、經部分或完全鹵化及/或帶有 1、2 或 3 個彼此獨立地選自由下列基團組成之群的取代基： C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_1 - C_4 烷氧基及 C_1 - C_4 鹵烷氧基，且其中

R^{1a} 係選自由下列基團組成之群：氫、羥基、 C_1 - C_6 烷氧基、胺基、(C_1 - C_6 烷基)胺基、二(C_1 - C_6

烷基)胺基、 C_1 - C_6 烷基、芳基、芳基- C_1 - C_6 烷基、3至7員雜芳基或雜芳基- C_1 - C_4 烷基，其中該雜芳基環含有作為環成員之1、2或3個選自由下列組成之群的雜原子：氮、氧、硫、基團SO、 SO_2 或 $N-R^n$ ，其中 R^n 為氫、 C_1 - C_6 烷基或(C_1 - C_6 烷基)-羰基；

R^2 、 R^3 及 R^4 係彼此獨立地選自由下列基團組成之群：

氫、鹵素、氰基、疊氮基、硝基、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_8 環烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 烷基磺醯基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、(C_1 - C_4 烷氧基)羰基、胺基、(C_1 - C_4 烷基)胺基、二(C_1 - C_4 烷基)胺基、胺基羰基、(C_1 - C_4 烷基)胺基羰基、二(C_1 - C_4 烷基)胺基羰基、磺醯基、磺醯胺基、次磺醯胺基、硫基胺基及 $C(=O)-R^{2a}$ 或 $C(=O)-R^{3a}$ 或 $C(=O)-R^{4a}$ ，且其中

R^{2a} 或 R^{3a} 或 R^{4a} 係選自由下列基團組成之群：氫、羥基、 C_1 - C_6 烷氧基、胺基、 C_1 - C_6 烷基、芳基、芳基- C_1 - C_6 烷基、(C_1 - C_6 烷基)-胺基、二(C_1 - C_6 烷基)-胺基、3至7員雜芳基或雜芳基- C_1 - C_4 烷基，其中該雜芳基環含有作為環成員之1、2或3個選自由下列組成之群的雜原子：氮、氧、硫、基團SO、 SO_2 或 NR^n ，其中 R^n 為氫、 C_1 - C_6 烷基或(C_1 - C_6 烷基)-羰基；

R^5 係選自由下列基團組成之群： OR^{5a} 、 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_3-C_{10} 環烷基，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1-4個選自由下列基團組成之群的基團： C_1-C_{10} 烷氧基、 C_1-C_{10} 烷硫基、 C_1-C_{10} 烷基亞磺基、 C_1-C_{10} 烷基磺基、 C_1-C_{10} 鹵烷氧基、 C_1-C_{10} 鹵烷硫基、(C_1-C_{10} 烷氧基)羰基、氰基、硝基、胺基、(C_1-C_{10} 烷基)胺基、二-(C_1-C_{10} 烷基)胺基、 C_3-C_{10} 環烷基及苯基，苯基可未經取代、經部分或完全鹵化及/或帶有1-3個選自由下列基團組成之群的取代基： C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基，且其中

R^{5a} 係選自氫、 C_1-C_{10} 烷基、 C_1-C_{10} 鹼基、 C_3-C_{10} 環烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、芳基、芳基- C_1-C_4 烷基、雜芳基及雜芳基- C_1-C_4 烷基、雜環基或雜環基- C_1-C_4 烷基，且其中該等基團之碳原子可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由下列基團組成之群的基團：氰基、硝基、胺基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亞磺基、 C_1-C_4 烷基磺基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷硫基、(C_1-C_4 烷氧基)羰基、(C_1-C_4 烷基)胺基、二(C_1-C_4 烷基)胺基及 C_3-C_8 環烷基；

R^6 係選自由下列基團組成之群： C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10}

烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_3-C_{10} 環烷基，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1-4個選自由下列基團組成之群的基團： C_1-C_{10} 烷氧基、 C_1-C_{10} 烷硫基、 C_1-C_{10} 烷基亞磺基、 C_1-C_{10} 烷基磺基、 C_1-C_{10} 鹵烷氧基、 C_1-C_{10} 鹵烷硫基、(C_1-C_{10} 烷氧基)羰基、氰基、硝基、胺基、(C_1-C_{10} 烷基)胺基、二-(C_1-C_{10} 烷基)胺基、 C_3-C_{10} 環烷基及苯基，苯基可未經取代、經部分或完全鹵化及/或帶有1-3個選自由下列基團組成之群的取代基： C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_1-C_6 烷氧基或 C_1-C_6 鹵烷氧基；

且其中該式I之化合物並不表示4-氯-3-N,N-二甲基-胺基-1,2-苯并異噻唑。

22. 如請求項21之式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之組合物，其中n為2。

23. 如請求項21之式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之組合物，其中n為0。

24. 如請求項21之式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之組合物，其中

R^1 為鹵素、 $C(=O)R^{1a}$ 、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_8 環烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由下列基團組成之群的基團： C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、(C_1-C_4 烷氧基)羰基及 C_3-C_8 環烷基，且其中

R^{1a} 係選自由下列基團組成之群：氫、羥基、 C_1 - C_6 烷氧基、胺基、(C_1 - C_6 烷基)胺基、二(C_1 - C_6 烷基)胺基、 C_1 - C_6 烷基、芳基及芳基- C_1 - C_6 烷基。

25. 如請求項21之式I之3-胺基-1,2-苯并異噻唑化合物或包含其之組合物，其中

R^1 為鹵素、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基，其中該等基團可未經取代、經部分或完全鹵化及/或可帶有1、2或3個選自由 C_1 - C_4 烷氧基及 C_1 - C_4 鹵烷氧基組成之群的基團。

七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：(無)

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

