



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201105234 A1

(43)公開日：中華民國 100 (2011) 年 02 月 16 日

(21)申請案號：099114183

(22)申請日：中華民國 99 (2010) 年 05 月 04 日

(51)Int. Cl.：

A01N37/18 (2006.01)

C07C237/44 (2006.01)

C07C255/57 (2006.01)

A01P5/00 (2006.01)

A01P7/00 (2006.01)

A01P9/00 (2006.01)

(30)優先權：2009/05/06

英國

0907824.7

2010/01/15

歐洲專利局

10150814.1

(71)申請人：先正達合夥公司 (瑞士) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (CH)

瑞士

(72)發明人：梅恩費曲 彼得 MAIENFISCH, PETER (CH)；古德費利 克里斯多夫 理查 亞

里斯 GODFREY, CHRISTOPHER RICHARD AYLES (GB)；裘格 皮耳 約瑟

瑪瑟爾 JUNG, PIERRE JOSEPH MARCEL (FR)；胡特 歐瑪 法蘭茲 HUETER,

OTTMAR FRANZ (DE)；雷諾德 彼得 RENOLD, PETER (CH)

(74)代理人：桂齊恆；閻啟泰

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：11 項 圖式數：0 共 89 頁

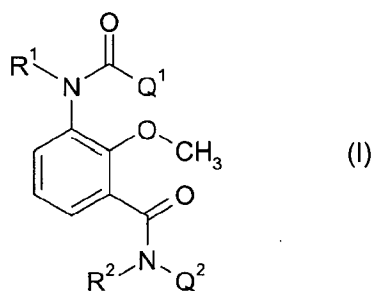
(54)名稱

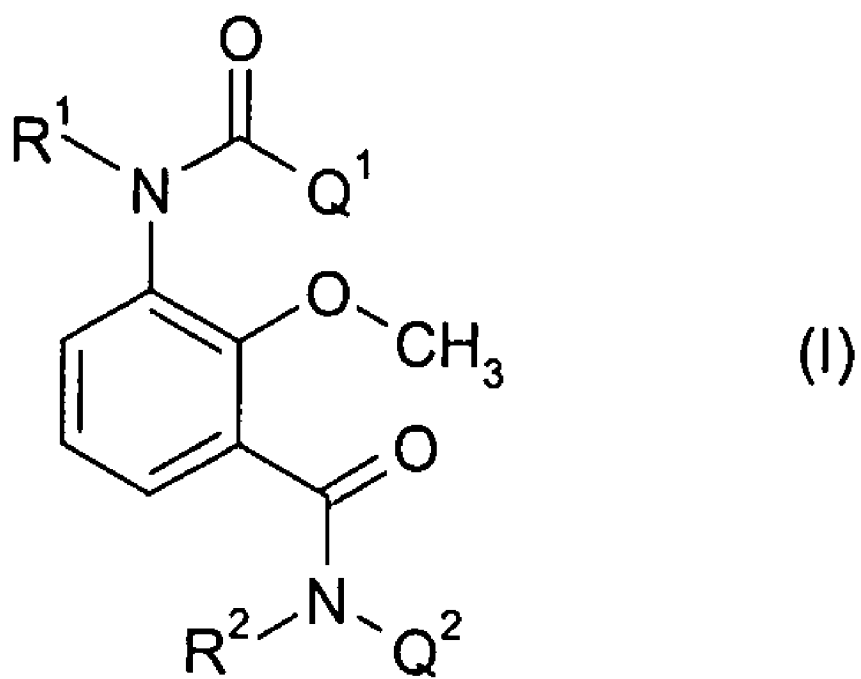
殺蟲化合物

INSECTICIDAL COMPOUNDS

(57)摘要

本發明係關於式(I)之雙-醯胺衍生物、用於製備該等衍生物之方法和中間產物、使用該等衍生物以控制昆蟲、蠅、線蟲和軟體動物有害生物之方法及包含該等衍生物的殺蟲、殺蠅、殺線蟲和殺軟體動物之組成物







(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201105234 A1

(43)公開日：中華民國 100 (2011) 年 02 月 16 日

(21)申請案號：099114183

(22)申請日：中華民國 99 (2010) 年 05 月 04 日

(51)Int. Cl.：

A01N37/18 (2006.01)

C07C237/44 (2006.01)

C07C255/57 (2006.01)

A01P5/00 (2006.01)

A01P7/00 (2006.01)

A01P9/00 (2006.01)

(30)優先權：2009/05/06

英國

0907824.7

2010/01/15

歐洲專利局

10150814.1

(71)申請人：先正達合夥公司 (瑞士) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (CH)

瑞士

(72)發明人：梅恩費曲 彼得 MAIENFISCH, PETER (CH)；古德費利 克里斯多夫 理查 亞

里斯 GODFREY, CHRISTOPHER RICHARD AYLES (GB)；裘格 皮耳 約瑟

瑪瑟爾 JUNG, PIERRE JOSEPH MARCEL (FR)；胡特 歐瑪 法蘭茲 HUETER,

OTTMAR FRANZ (DE)；雷諾德 彼得 RENOLD, PETER (CH)

(74)代理人：桂齊恆；閻啟泰

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：11 項 圖式數：0 共 89 頁

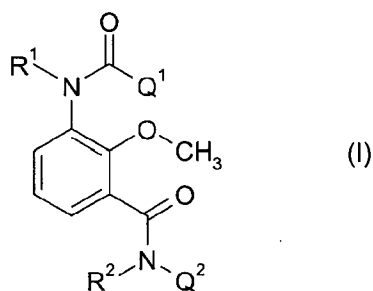
(54)名稱

殺蟲化合物

INSECTICIDAL COMPOUNDS

(57)摘要

本發明係關於式(I)之雙-醯胺衍生物、用於製備該等衍生物之方法和中間產物、使用該等衍生物以控制昆蟲、蠅、線蟲和軟體動物有害生物之方法及包含該等衍生物的殺蟲、殺蠅、殺線蟲和殺軟體動物之組成物



六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於雙-醯胺衍生物、用於製備該等衍生物之方法和中間產物、使用該等衍生物以控制昆蟲、蟎、線蟲和軟體動物有害生物之方法及包含該等衍生物的殺蟲、殺蟎、殺線蟲和殺軟體動物之組成物。

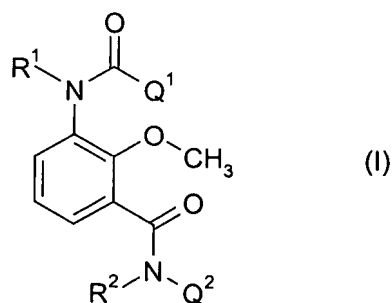
【先前技術】

具有殺蟲性質之化合物係揭示於例如 EP 1,714,958、JP 2006/306771、WO 2006/137376、EP 1,916,236、WO 2007/017075、WO 2008/000438、WO 2008/074427 和 WO 2009/049845 中。存在控制有害生物的替代方法之需要。較佳地，新穎化合物可具有改良的殺蟲性質，例如改良的效能、改良的選擇性、減少的毒性、產生抗性之較低趨向或抵抗較廣範圍的有害生物之活性。化合物可被更有利地調配或者提供更有效率的遞送和於作用位置的滯留，或可更快速地生物降解。

已令人驚訝地發現某些雙醯胺衍生物，其被芳基全氟丁基基團取代，其具有使其特別地適合用作為殺蟲劑之有利性質。

【發明內容】

本發明因此提供式(I)之化合物，



其中

Q^1 為芳基或雜環基，各自視需要地經一至五個 R^3 取代基取代，該 R^3 取代基可為相同或不同；

Q^2 係選自

2-乙基-6-甲基-4-(九氟丁-2-基)苯基、

2-溴基-6-氯基-4-(九氟丁-2-基)苯基、

2,6-二氯基-4-(九氟基-丁-2-基)苯基、

2,6-二甲基-4-(九氟基-丁-2-基)苯基、

2-氯基-6-甲氧基甲基-4-(九氟丁-2-基)苯基、及

2-溴基-6-甲氧基甲基-4-(九氟丁-2-基)苯基；

R^1 係選自氫、 C_1 - C_8 烷基、 C_1 - C_8 烷羰基、 C_1 - C_8 烷氧羰基和 C_1 - C_4 烷基- $C(O)NH_2$ ；

R^2 係選自氫、 C_1 - C_8 烷基、 C_1 - C_8 烷羰基、 C_1 - C_8 烷氧羰基和 C_1 - C_4 烷基- $C(O)NH_2$ ；及

R^3 係選自氰基、硝基、鹵素、羥基、乙醯氧基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷氧基、 CN - C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷基- $C(O)O$ 、 C_1 - C_4 烷基- $S(O)_2$ 、 NH_2 、 C_1 - C_4 烷基 NH 、 $(C_1$ - C_4 烷基) $_2N$ 、 $(C_1$ - C_4 烷基 O) $_2P(O)O$ 、苯基和包含 1 至 3 個獨立地選自氮、氧和硫之雜原子的五至六員單環雜環；

或其農業化學上可接受的鹽或 N-氧化物。

式(I)化合物可以不同的幾何或光學異構物(對映異構物及/或非對映異構物)或互變異構形式存在。本發明涵蓋所有該等異構物及互變異構物和其所有比例之混合物以及同位素型式如諸如氘化化合物。

除非另有說明，烷基，本身或作為其他基團之部分，諸如烷氧基、烷羰基或烷氧羰基，可為直鏈或支鏈且較佳可包含 1 至 6 個碳原子，更佳 1 至 4 個碳原子，和最佳地 1 至 3 個碳原子。烷基的例子包括甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、第二丁基、異丁基和第三丁基。

鹵素表示氟、氯、溴或碘。

鹵烷基基團可包含一或多個相同或不同的鹵素原子，且包括(例如)三氟甲基、氯二氟甲基、2,2,2-三氟乙基或 2,2-二氟乙基。全氟烷基基團為經氟原子完全取代之烷基基團且包括(例如)三氟甲基、五氟乙基、七氟丙-2-基和九氟基-丁-2-基。

芳基包括苯基、萘基、蒽基、茚基、菲基和聯苯基，且苯基為較佳。

雜芳基表示包括 1 至 6 個(較佳地 1 至 4 個，更佳地 1、2 或 3 個)獨立地選自氮、氧和硫之雜原子的包含 3 至 14 個(較佳地 4 至 10 個，更佳 4 至 7 個，最佳地 5 至 6 個)環原子之單-、二-或三環芳族烴。例子包括呋喃基、噻吩基、吡咯基、咪唑基、吡唑基、噻唑基、異噻唑基、𩇛唑基、異𩇛唑基、𩇛二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、嗒吡基、嘧啶基、吡嗪基、三吡基、四吡基(tetrazinyl)、𩇛

噪基、苯并噻吩基、異苯并呋喃基、苯并咪唑基、苯并噻二唑基、吲唑基、苯并三唑基、苯并噻唑基、苯并𪗇唑基、喹啉基、異喹啉基、吡嗪基、喹啉基、喹唑啉基、嘧啶基和嘧啶基。較佳者為包括 1、2 或 3 個獨立地選自氮、氧和硫之雜原子的包含 4 至 7 個(較佳地 5 至 6 個)環原子之單環雜芳基基團。

雜環，如使用在本文中，包括雜芳基，且除此之外可為包括 1 至 6 個(較佳地 1 至 4 個，更佳 1、2 或 3 個)獨立地選自氮、氧和硫之雜原子的包含 3 到 10 個環原子之飽和或部份不飽和單環或雙環烴。非芳族雜環基團的例子為氧雜環丙烷基、氮雜環丁烷基、四氫呋喃基、硫雜環戊烷基(thiolanyl)、吡咯啉基、吡咯啉基、咪唑啉基、咪唑啉基、環丁砜基、二氧雜環戊烷基、二氫吡喃基、四氫吡喃基、吡啶基、吡啶基、吡啶基、1,3-二𪗇烷基(dioxanyl)、1,4-二𪗇烷基、嗎啉基、二噻烷基(dithianyl)、硫代嗎啉基、哌嗪基、氮呋基、氧雜氮呋基、硫雜氮呋基、噻唑啉基、二氮雜環庚烷基(diazapanyl)、2,3-二氮苯并呋喃基、3,4-二氮-2H-苯并[b][1,4]二氧呋基、苯并[1,3]二氧雜環戊烷基和 2,3-二氮苯并[1,4]二氧雜環己二烯基(dioxinyl)。

Q^1 、 Q^2 、 R^1 、 R^2 和 R^3 之較佳值係以任何組合載於下文。

較佳地， Q^1 為芳基或雜芳基；各自視需要地經一至五個 R^3 取代基取代，該 R^3 取代基可為相同或不同。

更佳地， Q^1 係選自苯基、聯苯基和包含 1、2 或 3 個獨立地選自氮、氧和硫之雜原子的五至六員單環雜芳基基團；各自視需要地經一至五個 R^3 取代基取代，該 R^3 取代基

可為相同或不同。

仍更佳地， Q^1 係選自苯基、聯苯基、呋喃基、噻吩基、吡咯基、咪唑基、吡唑基、噻唑基、異噻唑基、𠵼唑基、異𠵼唑基、𠵼二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、嗒𠵼基、嘧啶基、吡𠵼基、三𠵼基、四𠵼基(tetrazinyl)、𠵼𠵼基、苯并噻吩基、苯并呋喃基、苯并咪唑基、苯并噻二唑基、𠵼𠵼基、苯并三唑基、苯并噻唑基、苯并𠵼𠵼基、喹𠵼基、異喹𠵼基、𠵼𠵼基、喹𠵼𠵼基、喹𠵼𠵼基、𠵼𠵼基和𠵼𠵼基；各自視需要地經一至五個 R^3 ，和更佳經一至三個 R^3 取代基取代，該 R^3 取代基可為相同或不同。

甚至更佳地， Q^1 係選自苯基、聯苯基、呋喃基、吡啶基、噻吩基、噻二唑基、𠵼𠵼基、異𠵼𠵼基、噻𠵼基、異噻𠵼基、吡𠵼基和嘧啶基；各自視需要經一至三個 R^3 取代基取代，該 R^3 取代基可為相同或不同。

較佳地， R^3 係選自氟基、硝基、氟基、氯基、溴基、碘基、羥基、乙醯氧基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷氧基、 CH_2 -CN、 $C(O)OCH_3$ 、 $S(O)_2CH_3$ 、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $OP(O)(CH_2CH_3)_2$ 、苯基、N-吡咯𠵼基(pyrrolyl)、噻二𠵼基、和吡𠵼基。

更佳地， R^3 係選自氟基、硝基、氟基、氯基、溴基、碘基、羥基、乙醯氧基、甲基、乙基、異丙基、第三丁基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、甲硫基、異丙硫基、3-乙氧基-正丙基、甲氧基甲基、2-甲氧基乙氧基、 CH_2CN 、 $C(O)OCH_3$ 、 $S(O)_2CH_3$ 、

NH_2 、 $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{OP}(\text{O})(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$ 、苯基、N-吡咯甲鹽基 (pyrrolyl)、噻二唑基、和吡啶基。

最佳地， R^3 係選自氟基、硝基、溴基、氯基、氟基、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基和三氟甲氧基。

最佳 Q^1 如在例子及表 A 至 M 之化合物中所定義。

較佳地， Q^2 係選自

2-乙基-6-甲基-4-(九氟基-丁-2-基)苯基、
2-溴基-6-氯基-4-(九氟基-丁-2-基)苯基、及
2,6-二氯基-4-(九氟基-丁-2-基)苯基。

較佳地， R^1 為氫。較佳地， R^2 為氫。

在第一較佳態樣中，本發明提供式 (I) 之化合物，其中 Q^2 為 2-乙基-6-甲基-4-(九氟基-丁-2-基)苯基；及 Q^1 、 R^1 、 R^2 和 R^3 定義於本文中。

在第一較佳態樣之較佳具體實例中，本發明提供式 (I) 之化合物，其中

Q^2 為 2-乙基-6-甲基-4-(九氟基-丁-2-基)苯基；

Q^1 係選自苯基、聯苯基、呋喃基、噻吩基、吡咯基、咪唑基、吡唑基、噻唑基、異噻唑基、𪗇唑基、異𪗇唑基、𪗇二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、嗒𪗇基、嘧啶基、吡𪗇基、三𪗇基、四𪗇基 (tetrazinyl)、𪗇𪗇基、苯并噻吩基、苯并呋喃基、苯并咪唑基、苯并噻二唑基、𪗇唑基、苯并三唑基、苯并噻唑基、苯并𪗇唑基、喹啉基、異喹啉基、𪗇𪗇基、喹𪗇基、喹𪗇基、𪗇𪗇基和𪗇𪗇基；各自視需要經一至三個 R^3 取代基取代，該 R^3 取代基可為相同或不同；

R^1 和 R^2 皆為氫；及

R^3 係選自氰基、硝基、氟基、氯基、溴基、碘基、羥基、乙醯氧基、甲基、乙基、異丙基、第三丁基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、甲硫基、異丙硫基、3-乙氧基-正丙基、甲氧基甲基、2-甲氧基乙氧基、 CH_2-CN 、 $C(O)OCH_3$ 、 $S(O)_2CH_3$ 、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $OP(O)(CH_2CH_3)_2$ 、苯基、N-吡咯甲醯基(pyrrolyl)、噻二唑基、和吡啶基。

在第一較佳態樣之更佳具體實例中，本發明提供式(I)之化合物，其中

Q^2 為 2-乙基-6-甲基-4-(九氟基-丁-2-基)苯基；

Q^1 係選自苯基、聯苯基、呋喃基、吡啶基、噻吩基、噻二唑基、噁唑基、異噁唑基、噻唑基、異噻唑基、吡唑基和嘧啶基；各自視需要經一至三個 R^3 取代基取代，該 R^3 取代基可為相同或不同；

R^1 和 R^2 皆為氫；及

R^3 係選自氰基、硝基、溴基、氯基、氟基、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基和三氟甲氧基。

在第二較佳態樣中，本發明提供式(I)之化合物，其中 Q^2 為 2-溴基-6-氯基-4-(九氟基-丁-2-基)苯基；及 Q^1 、 R^1 、 R^2 和 R^3 定義於本文中。

在第二態樣之較佳具體實例中，本發明提供式(I)之化合物，其中

Q^2 為 2-溴基-6-氯基-4-(九氟基-丁-2-基)苯基；

Q^1 係選自苯基、聯苯基、呋喃基、噻吩基、吡咯基、

咪唑基、吡唑基、噻唑基、異噻唑基、𪗇唑基、異𪗇唑基、𪗇二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、嗒𪗇基、嘧啶基、吡𪗇基、三𪗇基、四𪗇基(tetrazinyl)、𪗇噪基、苯并噻吩基、苯并呋喃基、苯并咪唑基、苯并噻二唑基、𪗇唑基、苯并三唑基、苯并噻唑基、苯并𪗇唑基、喹啉基、異喹啉基、𪗇𪗇基、喹𪗇基、喹唑𪗇基、𪗇𪗇基和𪗇𪗇基；各自視需要經一至三個 R^3 取代基取代，該 R^3 取代基可為相同或不同；

R^1 和 R^2 皆為氫；及

R^3 係選自氫基、硝基、氟基、氯基、溴基、碘基、羥基、乙醯氧基、甲基、乙基、異丙基、第三丁基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、甲硫基、異丙硫基、3-乙氧基-正丙基、甲氧基甲基、2-甲氧基乙氧基、 CH_2-CN 、 $C(O)OCH_3$ 、 $S(O)_2CH_3$ 、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $OP(O)(CH_2CH_3)_2$ 、苯基、N-吡咯甲醯基(pyrrolyl)、噻二唑基和吡啶基。

在第二較佳態樣之更佳具體實例中，本發明提供式(I)之化合物，其中

Q^2 為 2-溴基-6-氯基-4-(九氟基-丁-2-基)苯基；

Q^1 係選自苯基、聯苯基、呋喃基、吡啶基、噻吩基、噻二唑基、𪗇唑基、異𪗇唑基、噻唑基、異噻唑基、吡唑基和嘧啶基；各自視需要經一至三個 R^3 取代基取代，該 R^3 取代基可為相同或不同；

R^1 和 R^2 皆為氫；及

R^3 係選自氫基、硝基、溴基、氯基、氟基、甲基、乙

基、三氟甲基、甲氧基和三氟甲氧基。

在第三較佳態樣中，本發明提供式(I)之化合物，其中 Q^2 為 2,6-二氯基-4-(九氟基-丁-2-基)苯基；及 Q^1 、 R^1 、 R^2 和 R^3 被定義於其中。

在第三較佳態樣之較佳具體實例中，本發明提供式(I)之化合物，其中

Q^2 為 2,6-二氯基-4-(九氟基-丁-2-基)苯基；

Q^1 係選自苯基、聯苯基、呋喃基、噻吩基、吡咯基、咪唑基、吡唑基、噻唑基、異噻唑基、𪗇唑基、異𪗇唑基、𪗇二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、嗒吡基、嘧啶基、吡吡基、三吡基、四吡基(tetrazinyl)、𪗇噪基、苯并噻吩基、苯并呋喃基、苯并咪唑基、苯并噻二唑基、𪗇唑基、苯并三唑基、苯并噻唑基、苯并𪗇唑基、喹啉基、異喹啉基、𪗇吡基、喹𪗇基、喹唑基、𪗇基和𪗇啶基；各自視需要經一至三個 R^3 取代基取代，該 R^3 取代基可為相同或不同；

R^1 和 R^2 皆為氫；及

R^3 係選自氟基、硝基、氟基、氯基、溴基、碘基、羥基、乙醯氧基、甲基、乙基、異丙基、第三丁基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、甲硫基、異丙硫基、3-乙氧基-正丙基、甲氧基甲基、2-甲氧基乙氧基、 CH_2-CN 、 $C(O)OCH_3$ 、 $S(O)_2CH_3$ 、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $OP(O)(CH_2CH_3)_2$ 、苯基、N-吡咯甲醯基(pyrrolyl)、噻二唑基、和吡啶基。

在第三較佳態樣之更佳具體實例中，本發明提供式(I)

之化合物，其中

Q^2 為 2,6-二氯基-4-(九氯基-丁-2-基)苯基；

Q^1 係選自苯基、聯苯基、呋喃基、吡啶基、噻吩基、噻二唑基、噁唑基、異噁唑基、噻唑基、異噻唑基、吡唑基和嘧啶基；各自視需要經一至三個 R^3 取代基取代，該 R^3 取代基可為相同或不同；

R^1 和 R^2 皆為氫；及

R^3 係選自氟基、硝基、溴基、氯基、氰基、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基和三氟甲氧基。

最佳之式(I)化合物係選自

N-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基-苯基]-3-(4-氟基-2-甲基苯甲醯胺基)-2-甲氧基苯甲醯胺(表 A 之化合物編號 A5)；

N-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基苯基]-3-(4-氟基-2-氯苯甲醯胺基)-2-甲氧基苯甲醯胺(表 A 之化合物編號 A3)；

N-[2-溴基-6-氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)苯基]-3-(4-氟基-2-氯苯甲醯胺基)-2-甲氧基苯甲醯胺(表 B 之化合物編號 B2)；

N-[2-溴基-6-氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-苯基]-3-(4-氟基-2-甲基苯甲醯胺基)-2-甲氧基苯甲醯胺(表 B 之化合物編號 B1)；

N-[2,6-二氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)苯基]-3-(4-氟基-2-氯苯甲醯胺基)-2-甲氧基苯甲醯胺(表 C 之化合物編號 C1)；

N-[2,6-二氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)苯基]-3-(4-氟基-2-甲基苯甲醯胺基)-2-甲氧基苯甲醯胺(表 C 之化合物編號 C2)；

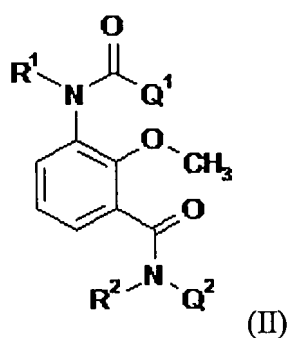
N-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基苯基]-3-(4-氟苯甲醯胺基)-2-甲氧基苯甲醯胺(表 A 之化合物編號 A1)；

N-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基-苯基]-3-(4-氟基苯甲醯胺基)-2-甲氧基苯甲醯胺(表 A 之化合物編號 A4)；

N-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基苯基]-3-(2-甲基-3-硝基苯甲醯胺基)-2-甲氧基苯甲醯胺(表 A 之化合物編號 A2)；及

N-{3-[2-溴基-6-氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-苯基胺甲醯基]-2-甲氧基苯基}-2,4,6-三氟苯甲醯胺(表 B 之化合物編號 B189)。

在另一態樣中，本發明提供式(II)之化合物，



其中 Q^1 、 R^1 、 R^2 和 R^3 如式(I)所定義和其較佳具體實例相當於式(I)之化合物；及

Q^2 係選自：

2-乙基-6-甲基-4-(全氟異丙基)苯基、

2-溴基-6-氯基-4-(全氟異丙基)苯基、
 2,6-二氯基-4-(全氟異丙基)苯基、
 2,6-二甲基-4-(全氟異丙基)苯基、及
 2-甲基-6-甲氧基甲基-4-(全氟異丙基)苯基。

在一較佳具體實例中，本發明提供式(II)之化合物，其中

Q^1 係選自苯基、聯苯基、呋喃基、吡啶基、噻吩基、噻二唑基、𪗇唑基、異𪗇唑基、噻唑基、異噻唑基、吡唑基和嘧啶基；各自視需要經一至三個 R^3 取代基取代，該 R^3 取代基可為相同或不同；

R^1 和 R^2 皆為氫；及

R^3 係選自氟基、硝基、溴基、氯基、氟基、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基和三氟甲氧基；及

Q^2 係選自；

2-乙基-6-甲基-4-(全氟異丙基)苯基、
 2-溴基-6-氯基-4-(全氟異丙基)苯基、
 2,6-二氯基-4-(全氟異丙基)苯基、
 2,6-二甲基-4-(全氟異丙基)苯基、及
 2-甲基-6-甲氧基甲基-4-(全氟異丙基)苯基；
 或其農業化學上可接受的鹽或 N-氧化物。

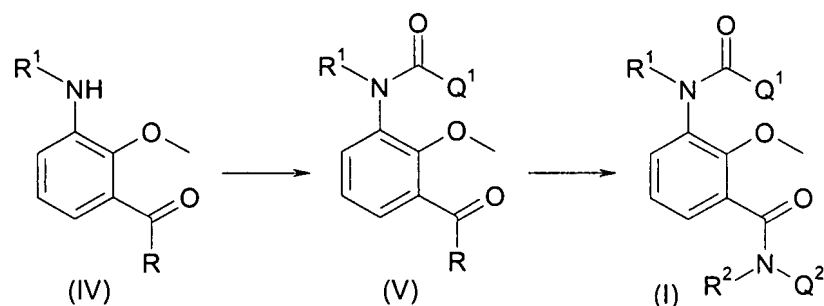
最佳之式(II)化合物為該等表 E、G、J、K 和 L 之化合物。

【實施方式】

本發明之化合物可藉由各種方法(例如，WO 08/000438

中所述之方法)製造。

1) 式(I)之化合物可藉由將式(V)之化合物(其中 R 為 OH、C₁-C₆ 烷氧基、Cl、F 或 Br)用式 NHR²Q² 之胺處理而製得。當 R 為 OH 時, 該等反應可在偶合試劑(諸如 DCC (N,N'-二環己基碳二亞胺)、EDC(1-乙基-3-[3-二甲胺基-丙基]碳二亞胺鹽酸鹽)或 BOP-Cl(雙(2-側氧基-3-𪗇唑啉基)膦醯氯(phosphinic chloride)))存在下、在鹼(諸如吡啶、三乙胺、4-(二甲胺基)吡啶或二異丙基乙胺)存在下, 以及視需要在親核性觸媒(諸如羥基苯并三唑)存在下進行。當 R 為 Cl 時, 該等反應可在鹼性條件下(例如在吡啶、三乙胺、4-(二甲胺基)吡啶或二異丙基乙胺存在下)及視需要在親核性觸媒存在下進行。或者, 該反應可在包括有機溶劑(較佳為乙酸乙酯)及水性溶劑(例較佳為碳酸氫鈉溶液)的雙相系統中進行。當 R 為 C₁-C₆ 烷氧基時, 可藉由在熱方法中將酯和胺一起加熱而將酯直接轉換成為醯胺。



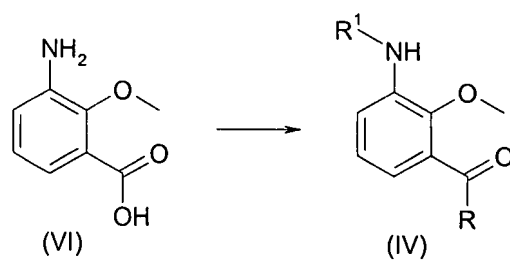
2) 式(V)之醯鹵類(其中 R 為 Cl、F 或 Br)可藉由用亞硫醯氯或草醯氯處理而從式(V)之羧酸類(其中 R 為 OH)製得。

3) 式(V)之羧酸類(其中 R 為 OH)可藉由在溶劑(諸如乙

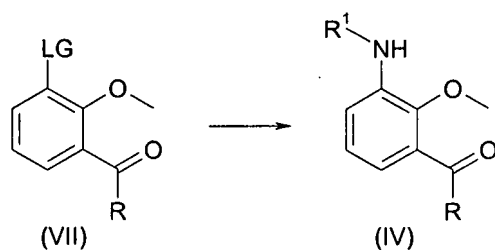
醇)中用鹼性氫氧化物(諸如氫氧化鈉)處理酯而從式(V)之酯類(其中 R 為 C_1-C_6 烷氧基)形成。

4) 式(V)之酯類(其中 R 為 C_1-C_6 烷氧基)可藉由在如 1) 中所述之標準條件下與式 Q^1-COOH 之羧酸或式 $Q^1-COHal$ 之醯鹵(其中 Hal 為 Cl、F 或 Br)的醯化作用而藉由處理式(IV)之化合物(其中 R 為 C_1-C_6 烷氧基)製得。

5) 式(IV)之化合物(其中 R 為 C_1-C_6 烷氧基)可藉由在酸性條件下用醇 $R-OH$ 及然後形成 $N-R^1$ 鍵連續處理而從式(VI)之化合物製得。例如，還原胺化作用(reduction amination)可藉由用醛或酮及還原劑諸如氰基硼氫化鈉處理胺而達成。或者，烷化作用可藉由用烷化劑諸如鹵烷處理胺，視需要在鹼存在下而達成。或者，芳基化作用可藉由用芳基鹵化物或磺酸酯在適當觸媒/配位基系統(時常為鈀(0)錯合物)存在下處理胺而達成。

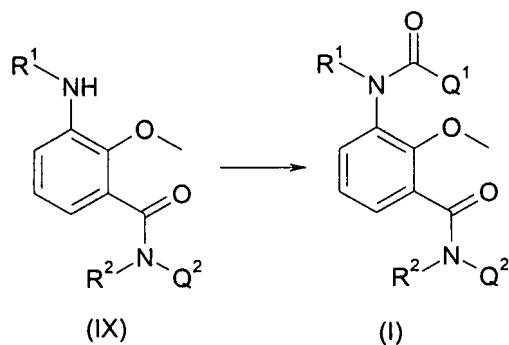


6) 或者，式(IV)之化合物(其中 R 為 C_1-C_6 烷氧基)可經由以式 R^1-NH_2 之胺或其他亞胺類似物置換脫離基，接著用金屬觸媒水解而從式(VII)之化合物(其中 R 為 C_1-C_6 烷氧基和 LG 為脫離基，諸如氟基、氯基或磺酸酯)製得。參見例如：Chemical Communications (2009)，(14)，1891-1893 或 Journal of Organic Chemistry (2000)，65(8)，2612-2614。

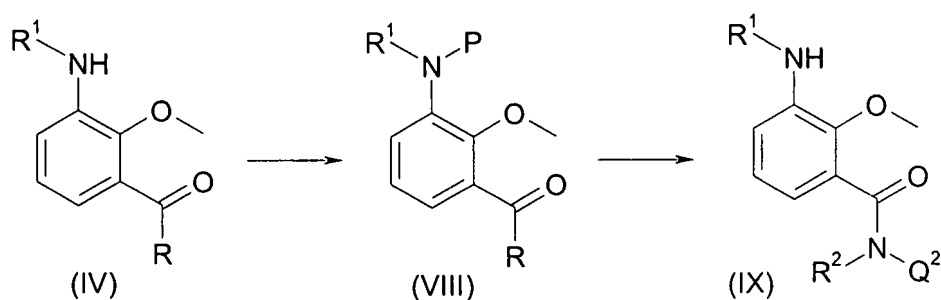


式(VII)之化合物和式 R^1-NH_2 之醃胺類為已知化合物或可藉由熟習該項技術者已知的方法製造。

7) 或者，式(I)之化合物，可藉由在如 1)中所述之標準條件下用式 Q^1-COOH 之羧酸或式 $Q^1-COHal$ 之醃鹵(其中 Hal 為 Cl、F 或 Br)處理式(IX)之化合物而製得。



8) 式(IX)之化合物可藉由在如 1)中所述之標準條件下與 NHR^2Q^2 之胺的醃胺鍵形成，接著在標準條件下除去保護基 P 而從式(VIII)之化合物(其中 P 為適當的保護基和 R 為 OH、 C_1 或 C_1-C_8 烷氧基)形成。



9) 式(VIII)之化合物(其中 R 為 OH 或 C_1-C_6 烷氧基)可

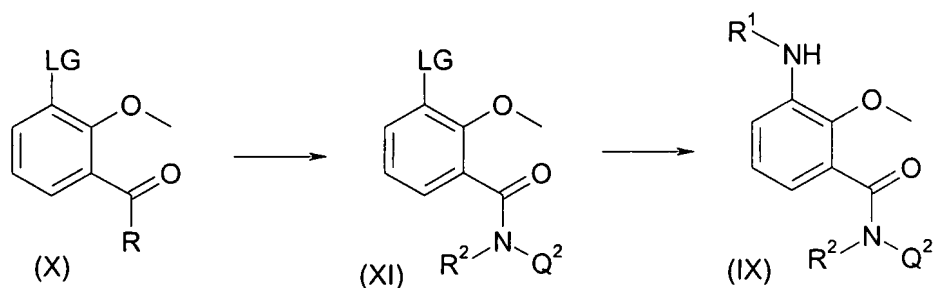
藉由保護式(IV)之化合物(其中 R 為 OH 或 C₁-C₆ 烷氧基)中的胺官能性而製得。適當保護基包括胺甲酸酯類(諸如第三丁氧羰基、烯丙氧羰基和苯甲氧羰基)、三烷矽基基團(諸如第三丁基二甲基-矽基)和醯基基團(諸如乙醯基)。

10) 關於式(VIII)之化合物和式(IV)之化合物，該等酯類(其中 R 為 C₁-C₆ 烷氧基)可藉由在溶劑(諸如乙醇)中用鹼性氫氧化物(諸如氫氧化鈉)處理而水解成酸類(其中 R 為 OH)。該等酸可藉由用如 2)和 3)中所述之亞硫醯氯或草醯氯處理而轉化成醯氯類(其中 R 為 Cl)。

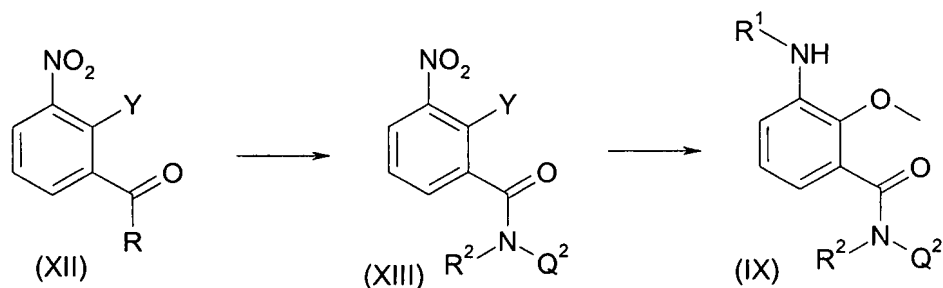
11) 或者，式(IV)之化合物(其中 R 為 OH、Cl、F、Br 或 C₁-C₆ 烷氧基)可藉由在如 1)中所述之標準條件下與式 NHR^2Q^2 之胺的醯胺鍵之形成而直接轉化成式(IX)之化合物。

12) 或者，式(IX)之化合物可藉由用式 $\text{R}^1\text{-NH}_2$ 之化合物或其他亞胺類似物置換脫離基，接著用金屬觸媒水解而從式(XI)之化合物(其中 LG 為脫離基諸如碘基、溴基、氯基或磺酸酯)製得。參見例如：Chemical Communications (2009)，(14)，1891-1893 或 Journal of Organic Chemistry (2000)，65(8)，2612-2614。

13) 式(XI)之化合物可經由在如 1)中所述之標準條件下的醯胺鍵形成而從式(X)之化合物(其中 R 為 Cl 或 OH 及 LG 為如 12)中所述之脫離基)製得。式(X)和式(IV)之化合物為已知化合物或可藉由熟習該項技術者已知的方法製造。



14) 式 (IX) 化合物 (其中 R^1 為氫) 之替代合成可藉由式 (XIII) 之硝基化合物的還原作用達成，諸如藉由在酸性條件下用氯化錫處理，或由貴金屬諸如鈀碳催化之氫化作用。



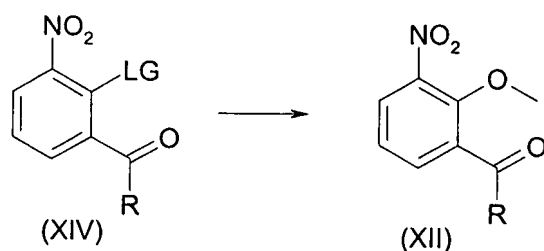
Y 為 LG 或 OMe

15) 式 (XIII) 之化合物可經由在如 1) 中所述之標準條件下與式 NHR^2Q^2 之胺的醯化作用而自式 (XII) 之化合物 (其中 R 為 OH、Cl 或 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷氧基) 衍生。

16) 對於式 (XII) 之化合物，該等酯 (其中 R 為 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷氧基) 可藉由在溶劑 (諸如如 3) 中所述之乙醇) 中用鹼性氫氧化物 (諸如氫氧化鈉) 處理而水解成酸類 (其中 R 為 OH)。該等酸可藉由用如 2) 中所述之亞硫醯氯或草醯氯處理而轉化成醯氯類 (其中 R 為 Cl)。式 (XII) 之化合物為已知的或可藉由熟習該項技術者已知的方法製造。

17) 式 (XII) 之化合物可藉由在鹼 (諸如 NaH) 存在下與甲醇反應而從式 (XIV) 之化合物 (其中 LG 為鹵素，諸如氟或

氣)製造。



鹵素用氧親核劑之置換也可在式(XIII)之中間物進行。

式(I)之化合物可用來控制昆蟲有害生物例如鱗翅目(Lepidoptera)、雙翅目(Diptera)、半翅目(Hemiptera)、纓翅目(Thysanoptera)、直翅目(Orthoptera)、蜚蠊目(Dictyoptera)、鞘翅目(Coleoptera)、蚤目(Siphonaptera)、膜翅目(Hymenoptera)和等翅目(Isoptera)以及其他無脊椎動物有害生物，諸如，蟎、線蟲和軟體動物的感染。昆蟲類、蟎類、線蟲類和軟體動物類在下文中總稱為有害生物。該等可藉由使用本發明化合物控制的有害生物包括該等與農業(該術語包括食物和纖維產物的作物之生長)、園藝和動物農事、寵物、林產和植物源(例如水果、穀粒和木材)的產物之儲存有關之有害生物；該等與人造結構的損害及人和動物的疾病傳播有關之有害生物；以及討厭的有害生物(例如蒼蠅)。

可被(I)化合物控制的有害生物種類之例子包括：桃蚜(*Myzus persicae*)(蚜蟲)、棉蚜(*Aphis gossypii*)(蚜蟲)、豆蚜(*Aphis fabae*)(蚜蟲)、盲蝽屬(*Lygus* spp.)(盲蝽(capsids)、紅椿屬(*Dysdercus* spp.)(盲蝽)、褐飛蝨(*Nilaparvata lugens*)(飛虱(planthopper))、黑尾葉蟬(*Nephotettix incticeps*)(葉蟬)、

綠椿屬 (*Nezara* spp.)(椿象)、褐椿屬 (*Euschistus* spp.)(椿象)、緣椿屬 (*Leptocorisa* spp.)(椿象)、西方花薊馬 (*Frankliniella occidentalis*)(薊馬)、薊馬屬 (*Thrips* spp.)(薊馬)、馬鈴薯甲蟲 (*Leptinotarsa decemlineata*)(科羅拉多馬鈴薯甲蟲 (Colorado potato beetle))、棉象蟲 (*Anthonomus grandis*)(棉鈴蟲 (boll worm))、介殼蟲屬 (*Aonidiella* spp.)(介殼蟲)、粉蝨屬 (*Trialeurodes* spp.)(白粉蝨 (white flies))、菸草粉蝨 (*Bemisia tabaci*)(白粉蝨)、歐洲玉米螟 (*Ostrinia nubilalis*)(歐洲玉米螟)、海灰翅夜蛾 (*Spodoptera littoralis*)(棉葉蟲 (cotton leafworm))、菸草青蟲 (*Heliothis virescens*)(煙夜蛾 (tobacco budworm))、玉米穗蟲 (*Helicoverpa armigera*)(棉鈴蟲)、美洲棉鈴蟲 (*Helicoverpa zea*)(棉鈴蟲)、棉捲葉螟 (*Sylepta derogata*)(棉捲葉蟲)、大菜粉蝶 (*Pieris brassicae*)(白粉蝶)、小菜蛾 (*Plutella xylostella*)(吊絲蟲 (diamond back moth))、地老虎屬 (*Agrotis* spp.)(切根蟲)、二化螟蟲 (*Chilo suppressalis*)(稻鑽心蟲)、飛蝗 (*Locusta migratoria*)(蝗蟲)、澳洲蝗蟲 (*Chortiocetes terminifera*)(蝗蟲)、條葉甲屬 (*Diabrotica* spp.)(根蟲)、蘋果全爪蟎 (*Panonychus ulmi*)(歐洲紅蟎)、柑橘全爪蟎 (*Panonychus citri*)(柑桔葉蟎)、二點葉蟎 (*Tetranychus urticae*)(二斑葉蟎 (two-spotted mite)、紅葉蟎 (*Tetranychus cinnabarinus*)(紅蜘蛛 (carmine spider mite))、柑桔銹蟎 (*Phyllocoptruta oleivora*)(柑桔鏽壁蟲 (citrus rust mite))、側多食跗線蟎 (*Polyphagotarsonemus latus*)(細蟎)、短鬚蟎屬 (*Brevipalpus* spp.)(平蟎 (flat mites))、牛壁蟲 (*Boophilus*

microplus)(牛蚤)、狗壁蝨(*Dermacentor variabilis*)(美洲狗蚤)、貓蚤(*Ctenocephalides felis*)(貓蚤)、斑潛蠅屬(*Liriomyza* spp.)(潛葉蟲(leafminer))、家蠅(*Musca domestica*)(家蠅)、埃及斑蚊(*Aedes aegypti*)(蚊蟲)、瘧蚊屬(*Anopheles* Spp.)(蚊蟲)、家蚊屬(*Culex* Spp.)(蚊蟲)、綠頭蒼蠅屬(*Lucillia* spp.)(麗蠅(blowflies))、德國蟑螂(*Blattella germanica*)(蟑螂)、美洲蟑螂(*Periplaneta americana*)(蟑螂)、東方蟑螂(*Blatta orientalis*)(蟑螂)、澳白蟻科(Mastotermitidae)(例如 *Mastotermes* spp.)、蘋白蟻科(Kalotermitidae)(例如新白蟻屬(*Neotermes* spp.))、鼻白蟻科(Rhinotermitidae)(例如家白蟻(*Coptotermes formosanus*)、黃肢散白蟻(*Reticulitermes flavipes*)、黃胸散白蟻(*R. speratus*)、南方散白蟻(*R. virginicus*)、西方散白蟻(*R. hesperus*)和桑特散白蟻(*R. santonensis*))和白蟻科(Termitidae)(例如黃球土白蟻(*Globitermes sulfureus*))之白蟻、熱帶火蟻(*Solenopsis geminata*)(火蟻)、小黃家蟻(*Monomorium pharaonis*)(法老蟻)、毛蟲屬(*Damalinia* spp.)和長顎虱屬(*Linognathus* spp.)(羽虱(biting lice)和血虱(sucking lice))、根瘤線蟲(*Meloidogyne* spp.)(根瘤線蟲)、包囊線蟲(*Globodera* spp.)和包囊線蟲(*Heterodera* spp.)(囊胞線蟲)、根腐線蟲屬(*Pratylenchus* spp.)(壞疽線蟲(lesion nematodes))、內侵線蟲屬(*Rhodopholus* spp.)(香蕉穿孔線蟲)、半穿刺蟲屬(*Tylenchulus* spp.)(柑桔線蟲)、捻轉胃蟲(*Haemonchus contortus*)(理發標線蟲(barber pole worm))、克氏蛔蟲(*Caenorhabditis elegans*)(醋小線蟲(vinegar eelworm))、毛圓

線蟲屬 (*Trichostrongylus* spp.)(消化道線蟲)和庭院灰蛭蝨 (*Deroceras reticulatum*)(蛭蝨)。

本發明因此提供控制昆蟲、蟎、線蟲或軟體動物之方法，其包含將殺蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物有效量的式(I)化合物或包含式(1)化合物之組成物施用於有害生物、有害生物所在地(較佳植物)或施用於容易被有害生物攻擊的植物。式(I)化合物較佳被用於對抗昆蟲或蟎。

術語「植物」如使用於本文中包括幼苗、灌木或樹。

應了解作物為也包括藉由習知的育種方法或藉由基因工程而對除草劑或除草劑類別(例如 ALS-、GS-、EPSPS-、PPO-和 HPPD-抑制劑)產生耐受性的作物。以習知的育種方法而對咪唑啉酮類(例如甲氧咪草煙(imazamox))產生耐受性的作物之例子為 Clearfield®夏日油菜(Canola)。以基因工程法而對除草劑產生耐受性的作物之例子包括以商標 RoundupReady®和 LibertyLink®商業上可得的抗嘉磷塞(glyphosate)-及抗固殺草(glufosinate)之玉米品種。

也應了解作物為該等藉由基因工程法已對有害昆蟲產生抗性之作物，諸如 Bt 玉米(抵抗歐洲玉米螟(European corn borer))、Bt 棉花(抵抗棉鈴象鼻蟲(cotton boll weevil))以及 Bt 馬鈴薯(抵抗科羅拉多甲蟲(Colorado beetle))。Bt 玉米的例子為 NK®之 Bt-176 玉米雜種(先正達種子公司(Syngenta Seeds))。包括一或多種為了抗殺蟲劑性編碼及表現一或多種毒素之基因的基因轉殖植物之例子為 KnockOut®(玉米)、Yield Gard®(玉米)、NuCOTIN33B®(棉花)、Bollgard®(棉花)、NewLeaf®(馬鈴薯)、NatureGard®和

Protexcta®。

植物作物和其種子物質二者可抗除草劑和同時也抗昆蟲吃食(「堆疊(stacked)」基因轉殖結果)。例如，種子可具有表現殺蟲 Cry3 蛋白質而同時耐嘉磷塞(glyphosate)之能力。

也應了解作物為該等藉由育種或基因工程的習知方法而獲得且包含所謂的輸出型性狀(output traits)(例如改良之儲藏穩定性、較高的營養價值和改善口味)之作物。

為了將式(I)之化合物以殺蟲劑、殺蟎劑、殺線蟲劑或殺軟體動物劑施用於有害生物、有害生物的所在地或易受有害生物侵襲的植物，式(I)之化合物通常被調配成組成物，其除了式(I)化合物之外，包括適當惰性稀釋劑或載劑，及視需要之界面活性劑(SFA)。SFA 等為能夠藉由降低界面張力修正界面(例如，液體/固體，液體/空氣或液體/液體界面)之性質和藉此導致其他性質(例如分散、乳化和濕潤)的改變之化學品。較佳的是所有組成物(固體和液態調配物兩者)包含(以重量計)0.0001 到 95%(更佳 1 到 85%，諸如 5 到 60%)之式(I)化合物。組成物通常使用於控制有害生物，致使以每公頃 0.1 克到 10 公斤，較佳每公頃 1 克到 6 公斤，更佳每公頃 1 克到 1 公斤的比率施用式(I)之化合物。

當使用於浸種時，式(I)之化合物係以每公斤種子 0.0001 克到 10 克(例如 0.001 克或 0.05 克)，較佳 0.005 克到 10 克，更佳 0.005 克到 4 克的比率使用。

在另一態樣中，本發明提供殺蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物之組成物，其包含殺蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體

動物有效量的式(I)化合物和為此的適當載劑或稀釋劑。組成物較佳為殺蟲或殺蟎組成物。

組成物可選自許多的調配物類型，包括可粉化粉劑(DP)、可溶性粉劑(SP)、水溶性粒劑(SG)、水分散性粒劑(WG)、可濕性粉劑(WP)、粒劑(GR)(慢或快速釋放)、可溶性濃縮物(SL)、油溶性液體(OL)、超低體積液體(UL)、可乳化濃縮物(EC)、分散性濃縮物(DC)、乳液(水包油型(EW)和油包水型(EO)兩者)、微乳液(ME)、懸浮濃縮物(SC)、噴霧劑、霧/煙調配物、膠囊懸浮液(CS)和種子處理調配物。在任何例子中所選擇的調配物類型將視所設想之特殊目的和式(I)化合物的物理、化學和生物的性质而定。

可粉化粉劑(DP)可藉由混合式(I)之化合物與一或多種固體稀釋劑(例如天然黏土、高嶺土、葉臘石、膨潤土、氧化鋁、微晶高嶺土、矽藻土(kieselguhr)、白堊、矽藻土(diatomaceous earth)、磷酸鈣、碳酸鈣和鎂、硫、石灰、穀粉、滑石和其他有機和無機固體載劑)及將混合物以機械研磨到細粉而製備。

可溶性粉劑(SP)可藉由將式(I)化合物與一或多種水溶性無機鹽類(如碳酸氫鈉、碳酸鈉或硫酸鎂)或一或多種水溶性有機固體(如多醣類)及視需要與一或多種濕潤劑、一或多種分散劑或該等試劑之混合物混合，以改良水分散度/溶解度而製備。接著將混合物研磨成細粉末。也可將相似的組成物粒化而形成水溶性粒劑(SG)。

可濕性粉劑(WP)可藉由混合式(I)之化合物與一或多種固體稀釋劑或載劑、一或多種濕潤劑、和較佳地一或多種

的分散劑，及視需要之一或多種的懸浮劑以促進在液體中的分散而製備。混合物然後磨成細粉。也可將相似的組成物粒化而形成水分散性粒劑(WG)。

粒劑(GR)可藉由將式(I)化合物和一或多種粉末固體稀釋劑或載劑的混合物粒化而形成，或藉由在多孔粒狀材料(例如浮石、綠坡縷石黏土、漂白土、矽藻土(kieselguhr)、矽藻土(diatomaceous earths)或研碎玉米梗)中吸收式(I)化合物(或其在適當試劑中之溶液)或藉由使式(I)化合物(或其在適當試劑中之溶液)吸附在硬核心材料(例如砂、矽酸鹽、礦物碳酸鹽、硫酸鹽或磷酸鹽)上且如果需要的話乾燥，而從預先形成的空白顆粒形成。常用於幫助吸收或吸附的試劑包括溶劑(例如脂族和芳族石油溶劑、醇類、醚類、酮類和酯類)和黏著劑(例如聚乙酸乙烯酯類、聚乙烯醇類、糊精類、糖類和植物油類)。一或多種其他的添加劑也可包含在粒劑中(例如乳化劑、濕潤劑或分散劑)。

分散性濃縮液(DC)可藉由將式(I)之化合物溶解在水或有機溶劑(例如酮、醇或二醇醚中)而製備。這些溶液可包含界面活性劑(例如以改良水稀釋或防止在噴灑箱中結晶)。

可乳化濃縮物(EC)或水包油型乳液(EW)可藉由將式(I)之化合物溶解在有機溶劑(視需要地包含一或多種濕潤劑、一或多種的乳化劑或該等試劑的混合物)中而製得。用於 EC 中的適當有機溶劑包括芳烴類(例如烷基苯類或烷基萘類，以 SOLVESSO 100、SOLVESSO 150 和 SOLVESSO 200 為例；SOLVESSO 為註冊商標)、酮類(例如環己酮或甲基環己酮)和醇類(例如苯甲醇、糠醇或丁醇)、*N*-烷基吡咯啉酮類(例

如 *N*-甲基吡咯啉酮或 *N*-辛基吡咯啉酮)、脂肪酸的二甲基鹽胺類(例如 C₈-C₁₀ 脂肪酸二甲基鹽胺)和氯化烴類。EC 產物在加到水中時可自然地乳化，產生具有足夠穩定性的乳液而允許經由適當裝備噴灑施用。EW 的製備涉及獲得呈液體(如果其在室溫下不是液體，其可在合理的溫度下，典型地在 70°C 以下熔化)或在溶液中(藉由將其溶解在適當溶劑中)的式(I)化合物及然後在高剪切下將所得液體或溶液乳化於包含一或多種 SFA 之水中，以產生乳液。使用於 EW 中的適當溶劑包括植物油類、氯化烴類(諸如氯苯類)、芳族溶劑(例如烷基苯類或烷基萘類)和其他在水中具有低溶解度之適當有機溶劑。

微乳液(ME)可藉由混合水和一或多種溶劑與一或多種 SFA 的摻合物而製備，以自然地產生熱力學穩定之等向性液態調配物。式(I)之化合物最初以水或溶劑/SFA 摻合物存在。使用於 ME 中的適當溶劑包括該等上述使用於 EC 或 EW 之溶劑。ME 可為水包油型或油包水型系統(該系統存在可藉由導電率測量測定)和可適合於將水溶性和油溶性殺蟲劑混合在相同調配物中。ME 適合於稀釋在水中，或保持微乳液或形成一種習知水包油型乳液。

懸浮濃縮物(SC)可包含式(I)化合物的細碎不溶性固體粒子之水性或非水性懸浮液。SC 可藉由在適當介質中將式(I)的固體化合物球磨或珠磨，視需要地與一或多種分散劑一起，以產生化合物的細粒懸浮液而製備。一或多種濕潤劑可包含在組成物中且可包括懸浮劑以減少粒子沉降的速率。或者，式(I)化合物可乾磨和加至水(包含上述試劑)

中以產生所要的最終產物。

噴霧劑調配物包含式(I)化合物和適當的推進劑(例如正丁烷)。式(I)之化合物也可溶解或分散在適當介質(例如水或水溶混性液體，諸如正丙醇)以提供使用於非加壓手動噴灑泵之組成物。

式(I)化合物可以乾燥狀態與煙火(pyrotechnic)混合物混合以形成適合於在封閉空間中產生包含化合物的煙霧之組成物。

膠囊懸浮液(CS)可藉由類似於製備 EW 調配物的方法製備，但用額外聚合階段以使獲得油滴的水性分散液，其中每個油滴以聚合殼包封且包含式(I)之化合物和為之視需要的載劑或稀釋劑。聚合殼可藉由界面縮聚反應或藉由凝聚程序產生。組成物可提供於式(I)化合物的控制釋放且其可用於種子處理。式(I)之化合物也可調配在生物可降解聚合基質中以提供化合物的緩慢控制釋放。

組成物可包括一或多種添加劑以改良組成物的生物效能(例如藉由改良表面的濕潤、滯留或分佈；處理表面的抗雨性；或式(I)化合物的吸收或流動性)。該等添加劑包括界面活性劑、以油為主之噴霧添加劑，諸如某些礦物油類或天然植物油類(例如大豆和油菜子油)，和這些與其他的生物增強佐劑(可幫助或改良式(I)化合物之作用的成分)之摻合物。

也可將式(I)化合物調配成用於種子處理，諸如成為粉劑組成物(包含用於乾種子處理(DS)之粉劑、水溶性粉劑(SS)或用於漿料處理之水分散性粉劑(WS))或成為液體組成物

(包含可流動濃縮物(FS)、溶液(LS)或膠囊懸浮液(CS))。DS、SS、WS、FS及LS組成物之製備分別非常類似於上述的DP、SP、WP、SC及DC組成物的製備。用於處理種子之組成物可包含有助於組成物黏著於種子的試劑(例如礦物油或膜形成阻劑)。

濕潤劑、分散劑及乳化劑可為陽離子、陰離子、兩性或非離子型之表面SFA。

陽離子型之適當SFA包括四級銨化合物(例如溴化十六基三甲基銨)、咪唑啉類和胺鹽類。

適當陰離子SFA包括脂肪酸之鹼金屬鹽類、硫酸的脂肪族單酯之鹽類(例如月桂基硫酸鈉)、磺酸化芳香族化合物之鹽類(例如十二基苯磺酸鈉、十二基苯磺酸鈣、丁基萘磺酸鹽及二-異丙基-與三-異丙基-萘磺酸鈉之混合物)、醚硫酸鹽、醇醚硫酸鹽(例如月桂醇聚氧乙烯醚-3-硫酸鈉(sodium laureth-3-sulfate))、醚羧酸鹽(例如月桂醇聚氧乙烯醚-3-羧酸鈉)、磷酸酯(來自一或多種脂肪醇與磷酸(以單酯優先)或五氧化二磷(以二酯優先)之間的反應之產物,諸如在月桂醇與四磷酸之間的反應,此外可將這些產物乙氧基化)、磺酸基琥珀醯胺酸鹽、石蠟或烯烴磺酸鹽、牛脂酸鹽(taurate)及木質磺酸鹽。

適當兩性型之SFA包括甜菜鹼類、丙酸鹽類及甘胺酸鹽類。

適當非離子型SFA包括環氧烷類(諸如環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物)與脂肪醇(諸如油醇或十六基醇)或與烷酚類(如辛酚、壬酚或辛甲酚)之縮合產物;衍生自長

鏈脂肪酸或己糖醇酐之部分酯類；該部分酯類與環氧乙烷之縮合產物；嵌段聚合物(其包含環氧乙烷和環氧丙烷)；烷醇醯胺類；簡單酯類(例如脂肪酸聚乙二醇酯)；氧化胺類(例如氧化月桂基二甲胺)及卵磷脂。

適當懸浮劑包括親水性膠體(如多醣類、聚乙烯基吡咯啉酮或羧甲基纖維素鈉)及膨脹黏土(諸如膨潤土或鎂鋁海泡石)。

式(I)化合物可以任何施用除害化合物的已知方式施用。例如，可將經調配或未經調配之化合物直接地施用於有害生物或有害生物之所在地(例如有害生物棲息地，或易受有害生物感染之生長植物)或施用於植物的任何部分(包括葉片、梗、枝或根部)、在種植之前的種子或其它植物生長或種植之介質(諸如圍繞根部的土壤，一般為土壤、稻田水或水栽培育系統)，或可將其噴灑或灑粉在土壤中或水性環境上，將其以浸泡施用、以乳膏或糊料調配物施用、以蒸氣施用或經由分配或併入組成物中(如粒劑組成物或包裝在水溶性袋子中的組成物)而施用在土壤中或水性環境中。

也可將式(1)化合物注入植物中或使用電力學噴霧技術或其它的低容量法噴灑在植被上，或以地面或空中灌溉系統施用。

用作為水性製劑(水溶液或分散液)的組成物通常以包含高比例的活性成分的濃縮物形式供應，濃縮物係在使用之前加至水中。這些可包括 DC、SC、EC、EW、ME、SG、SP、WP、WG 及 CS 之濃縮物常需要耐得住長期貯存，並在該貯存之後，能夠將其加入水中形成水性製劑，其維持均

勻達足夠時間以使彼等能夠以習用的噴灑設備施用。該等水性製劑可包含改變量的式(I)化合物(例如 0.0001 至 10 重量%)，其視彼等欲使用的目的而定。

式(I)化合物可用在與肥料(例如含氮-、鉀-或磷-之肥料)的混合物中。適合的調配物型式包括肥料之粒劑。混合物較佳地包含高達 25 重量%之式(I)化合物。

本發明因此也提供含包含肥料及式(I)化合物之肥料組成物。

本發明的組成物可包含其它具有生物活性之化合物(例如微營養素)，或具有殺真菌活性或具有植物生長調節、除草、殺蟲、殺線蟲或殺蟎活性之化合物。

式(I)化合物可為組成物的唯一活性成分或其在適當情況下可與一或多種額外的活性成分(諸如除害劑、殺真菌劑、增效劑、除草劑或植物生長調節劑)混合。額外的活性成分可：提供具有更寬的活性範圍或增加於所在地的持續性之組成物；使式(I)化合物的活性增效或補充其活性(例如藉由增加作用速度或克服排斥性)；或有助於克服或避免對個別成分發生抗性。特別之額外活性成分將視所要之組成物的利用性而定。適當除害劑的例子包括下列：

a) 合成除蟲菊精類(pyrethroids)，諸如百滅寧(permethrin)、賽滅寧(cypermethrin)、芬化利(fenvalerate)、益化利(esfenvalerate)、第滅寧(deltamethrin)、賽洛寧(cyhalothrin)(特別是 λ -賽洛寧(lambda-cyhalothrin))、畢芬寧(bifenthrin)、芬普寧(fenpropathrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、太氟寧(tefluthrin)、魚安全合成除蟲菊精類(例如埃索芬普

(ethofenprox))、天然除蟲菊精(pyrethrin)、治滅寧(tetramethrin)、右亞列寧(S-bioallethrin)、芬福寧(fenfluthrin)、炔丙菊酯(prallethrin)或5-苯甲基-3-呋喃甲基-(E)-(1R,3S)-2,2-二甲基-3-(2-亞氧雜硫雜環戊烷(oxothiolan)-3-基甲基)環丙烷羧酸酯；

b) 有機磷酸鹽類，諸如，佈飛松(profenofos)、蘇佈松(sulprofos)、毆殺松(acephate)、甲基巴拉松(parathion)、谷速松(azinphos-methyl)、滅賜松(demeton-s-methyl)、飛達松(heptenophos)、硫滅松(thiometon)、芬滅松(fenamiphos)、亞素靈(monocrotophos)、佈飛松(profenofos)、三落松(triazophos)、達馬松(methamidophos)、大滅松(dimethoate)、福賜米松(phosphamidon)、馬拉松(malathion)、陶斯松(chlorpyrifos)、裕必松(phosalone)、托福松(terbufos)、繁福松(fensulfothion)、大福松(fonofos)、福瑞松(phorate)、巴賽松(phoxim)、亞特松(pirimiphos-methyl)、必滅松(pirimiphos-ethyl)、撲滅松(fenitrothion)、福賽絕(fosthiazate)或大利松(diazinon)；

c) 胺基甲酸酯類(包括胺基甲酸芳酯)，諸如比加普(pirimicarb)、曲紮美特(triazamate)、克索卡(cloethocarb)、加保扶(carbofuran)、呋線威(furathiocarb)、愛殺芬卡(ethiofencarb)、得滅克(aldicarb)、索福羅斯(thiofurox)、丁基加保扶(carbosulfan)、免敵克(bendiocarb)、丁基滅必蟲(fenobucarb)、安丹(propoxur)、納乃得(methomyl)或毆殺滅(oxamyl)；

d) 苯甲醯脲類，諸如二福隆(diflubenzuron)、三福隆

(triflumuron)、六伏隆(hexaflumuron)、氟芬隆(flufenoxuron)或克福隆(chlorfluazuron)；

e) 有機錫化合物，諸如錫蟊丹(cyhexatin)、芬佈賜(fenbutatin oxide)或亞環錫(azocyclotin)；

f) 吡唑類，諸如替布芬比(tebufenpyrad)和芬普蟊(fenpyroximate)；

g) 大環內酯類，諸如阿凡曼菌素(ivermectin)或米貝黴素類(milbemycins)，例如阿巴汀(abamectin)、因滅汀(emamectin benzoate)、伊維菌素(ivermectin)、米貝黴素(milbemycin)、賜諾殺(spinosad)、印楝素(azadirachtin)或斯必托蘭(spinetoram)；

h) 激素類或費洛蒙類；

i) 有機氯化合物，諸如安殺番(endosulfan)(特別是 α -安殺番)、六氯化苯、DDT、克氯丹(chlordane)或地特靈(dieldrin)；

j) 脒類，諸如氯苯甲脒(chlordimeform)或三亞蟊(amitraz)；

k) 薰煙劑，諸如氯化苦(chloropicrin)、二氯丙烷、溴甲烷或美坦(metam)；

l) 新菸鹼類化合物，諸如益達胺(imidacloprid)、賽克培(thiacloprid)、亞滅培(acetamiprid)、耐特必爛(nitenpyram)、達特南(dinotefuran)、蘇福羅(sulfoxaflor)、賽速安(thiamethoxam)、可尼丁(clothianidin)、硝乙脲噻唑(nithiazine)或氟啶蟲醯胺(flonicamid)；

m) 二醯基肼類，諸如得芬諾(tebufenozide)、環蟲肼

(chromafenozide)或甲氧芬立(methoxyfenozide)；

n) 二苯醚類，諸如多芬藍(diofenolan)或派立普斯芬(pyriproxifen)；

o) 因得克(Indoxacarb)；

p) 克凡派(Chlorfenapyr)；

q) 吡蚜酮(Pymetrozine)；

r) 螺蟲乙酯(Spirotetramat)、季酮蟎酯(spirodiclofen)或表螺甲蟎酯(spiromesifen)；

s) 二醯胺類，諸如含氟蟲醯胺(flubendiamide)、氟蟲苯甲醯胺(chlorantraniliprole)或氟蟲苯甲醯胺(cyantraniliprole)；

t) 蘇福羅(sulfoxaflor)；或

u) 氟氟蟲脞(Metaflumizone)。

除上列除害劑之主要化學類別之外，如果對於所欲之組成物的利用性適當的話，其他具有特別目的之除害劑可使用於組成物中。例如，可使用特定作物之選擇性殺蟲劑，例如使用於米的鑽心蟲(stemborer)特異性殺蟲劑(諸如培丹(cartap))或飛蟲特異性殺蟲劑(諸如布芬淨(buprofezin))。或者，對特定昆蟲的種類/階段具有特異性之殺蟲劑或殺蟎劑也可包含在組成物中(例如殺蟎卵-幼蟲劑，諸如，諸如克芬蟎(clofentezine)、氟苯米(flubenzimine)、合賽多(hexythiazox)或得脫蟎(tetradifon)；殺蟎殺成蟲劑(motilicides)，諸如大克蟎(dicofol)或毆蟎多(propargite)；殺蟎劑，諸如新殺蟎(bromopropylate)或克氯苯(chlorobenzilate)；或生長調節劑，諸如愛美松(hydramethylnon)、賽滅淨(cyromazine)、甲

氧普烯 (methoprene)、克福隆 (chlorfluazuron) 或二福隆 (diflubenzuron))。

可包括在本發明組成物中之殺真菌劑的例子為(E)-*N*-甲基-2-[2-(2,5-二甲基苯氧基甲基)苯基]-2-甲氧基-亞胺基乙醯胺基 (SSF-129)、4-溴基-2-氰基-*N,N*-二甲基-6-三氟甲基苯并咪唑-1-磺醯胺、 α -[*N*-(3-氯基-2,6-二甲苯基)-2-甲氧基乙醯胺基]- γ -丁內酯、4-氯基-2-氰基-*N,N*-二甲基-5-對甲苯基咪唑-1-磺醯胺 (IKF-916、斯美達沙米 (cyamidazosulfamid))、3-5-二氯基-*N*-(3-氯基-1-乙基-1-甲基-2-側氧丙基)-4-甲基苯甲醯胺 (RH-7281、佐殺滅 (zoxamide))、*N*-烯丙基-4,5,-二甲基-2-三甲矽基噻吩-3-甲醯胺 (MON65500)、*N*-(1-氰基-1,2-二甲基丙基)-2-(2,4-二氯苯氧基)丙醯胺 (AC382042)、*N*-(2-甲氧基-5-吡啶基)-環丙烷甲醯胺、阿昔貝拉 (acibenzolar) (CGA245704)、棉鈴威 (alanycarb)、阿地莫非 (aldimorph)、敵菌靈 (anilazine)、阿扎康唑 (azaconazole)、亞托敏 (azoxystrobin)、本達樂 (benalaxyl)、免賴得 (benomyl)、惡霜靈 (biloxyzol)、比多農 (bitertanol)、保米黴素 (blasticidin S)、溴克座 (bromuconazole)、布瑞莫 (bupirimate)、四氯丹 (captafol)、蓋普丹 (captan)、貝芬替 (carbendazim)、貝芬替氫氯酸鹽 (chlorhydrate)、萎鏽靈 (carboxin)、加普胺 (carpropamid)、香芹酮 (carvone)、CGA41396、CGA41397、甲基克殺蟎 (chinomethionate)、四氯異苯腈 (chlorothalonil)、氯諾立那 (chlorozolinate)、克拉康 (clozylacon)、含銅化合物例如氯氧化銅 (copper oxychloride)、氧基氫醌銅 (copper oxyquinolate)、硫酸銅、

樹脂酸銅(copper tallate)和波爾多(Bordeaux)混合物、克絕(cymoxanil)、環克座(cyproconazole)、賽普洛(cyprodinil)、得巴卡(debacarb)、二-2-吡啶基二硫化物 1,1'-二氧化物、益發靈(dichlofluanid)、達滅淨(diclomezine)、大克爛(dicloran)、鮑滅爾(diethofencarb)、待克利(difenoconazole)、燕麥枯(difenzoquat)、二氟林(diflumetorim)、硫代磷酸 O,O-二-異-丙基-S-苯甲酯、地美福唑(dimefluazole)、地美康唑(dimetconazole)、達滅芬(dimethomorph)、二甲嘧酚(dimethirimol)、達克利(diniconazole)、白粉克(dinocap)、腈硫醌(dithianon)、十二基二甲基氯化銨、十二環嗎啉(dodemorph)、多寧(dodine)、多瓜地(dogquadine)、護粒松(edifenphos)、依普座(epoxiconazole)、依瑞莫(ethirimol)、(Z)-N-苯甲基-N([甲基(甲基-硫亞乙基胺氧羰基)胺基]硫基)-β-丙胺酸乙酯、依得利(etridiazole)、凡殺多(famoxadone)、芬滅多(fenamidone)(RPA407213)、芬瑞莫(fenarimol)、芬克座(fenbuconazole)、芬福瑞(fenfuram)、芬海米(fenhexamid)(KBR2738)、芬哌克尼(fenpiclonil)、芬撲定(fenpropidin)、芬必莫(fenpropimorph)、三苯醋錫(fentin acetate)、三苯羥錫(fentin hydroxide)、富爾邦(ferbarn)、嘧菌腓(ferimzone)、扶吉胺(flauzinam)、護汰寧(fludioxonil)、氟美托(flumetover)、氟美地(fluoroimide)、氟喹康唑(flquinconazole)、護矽得(flusilazole)、福多寧(flutolanil)、護汰芬(flutriafol)、福爾培(folpet)、麥穗寧(fuberidazole)、福拉斯(furalaxyl)、福拉比(furametpyr)、克熱淨(guazatine)、菲克利(hexaconazole)、羥基異噁唑、殺紋寧

(hymexazole)、依滅列(imazalil)、易胺座(imibenconazole)、雙胍辛胺(iminoctadine)、雙胍辛胺三乙酸鹽、依康唑(ipconazole)、丙基喜樂松(iprobenfos)、依普同(iprodione)、依普瓦立(iprovalicarb)(SZX0722)、胺基甲酸異丙酯丁酯、亞賜圃(isoprothiolane)、嘉賜黴素(kasugamycin)、克收欣(kresoxim-methyl)、LY186054、LY211795、LY248908、鋅錳乃浦(mancozeb)、錳乃浦(maneb)、甲霜靈(mefenoxam)、滅派林(mepanipyrim)、滅普寧(mepronil)、滅達樂(metalaxyl)、滅克座(metconazole)、免得爛(metiram)、免得爛-鋅、苯氧菌胺(metominostrobin)、邁克尼(myclobutanil)、尼索立(neoasozin)、二甲基二硫代胺基甲酸鎳、尼秋沙(nitrothal)-異丙基、尼瑞莫(nuarimol)、歐福拉(ofurace)、有機汞化合物、歐殺斯(oxadixyl)、氧殺福隆(oxasulfuron)、歐林索酸(oxolinic acid)、歐伯克座(oxpoconazole)、嘉保信(oxycarboxin)、披扶座(pefurazoate)、平克座(penconazole)、賓克隆(pencycuron)、殺枯淨(phenazin oxide)、伏捨替(phosetyl)-al、磷酸、熱必斯(phthalide)、吡可斯賓(picoxystrobin)(ZA1963)、保粒黴素(polyoxin) D、代森聯(polyram)、撲殺熱(probenazole)、撲克拉(prochloraz)、撲滅寧(procymidone)、普拔克(propamocarb)、普克利(propiconazole)、甲基鋅乃浦(propineb)、丙酸、白粉松(pyrazophos)、比芬諾(pyrifenox)、必滅寧(pyrimethanil)、百快隆(pyroquilon)、彼斯福(pyroxyfur)、吡咯尼群(pyrrolnitrin)、四級銨化合物、蟎離丹(quinomethionate)、奎諾斯芬(quinoxyfen)、五氯硝苯(quintozene)、西克座

(sipconazole)(F-155)、五氯酚鈉、螺殺胺(spiroxamine)、鏈黴素(streptomycin)、硫、得克利(tebuconazole)、克枯爛(tecloftalam)、四氯硝基苯(tecnazene)、四克利(tetraconazole)、腐絕(thiabendazole)、塞福滅(thifluzamid)、2-(硫氰基甲硫基)苯并噻唑、甲基多保淨(thiophanate-methyl)、得恩地(thiram)、替咪苯康唑(timibenconazole)、脫克松(tolclofos-methyl)、托福寧(tolyfluanid)、三泰芬(triadimefon)、三泰隆(triadimenol)、三布替(triazbutil)、三唑氧(triazoxide)、三賽唑(tricyclazole)、三得芬(tridemorph)、三氟敏(trifloxystrobin)(CGA279202)、賽福寧(triforine)、賽福座(triflumizole)、環菌唑(triticonazole)、維利黴素 A(validamycin A)、衛本(vapam)、免克寧(vinclozolin)、鋅乃浦(zineb)和福美鋅(ziram)。

式(I)之化合物可與用於保護植物以抗種子生疾病、土生疾病或葉真菌疾病的土壤、泥煤或其他的生根介質混合。

用於組成物中的適當增效劑之例子包括丁氧化胡椒基、斯沙美(sesamex)、沙福羅沙(safroxan)和十二基咪唑。

用於包含在組成物中之適當除草劑和植物生長調節劑將視所欲的目標及所要效果而定。

可被包括的稻米選擇性除草劑之例子為除草靈(propanil)。使用於棉花的植物生長調節劑之例子為 PIXTM。

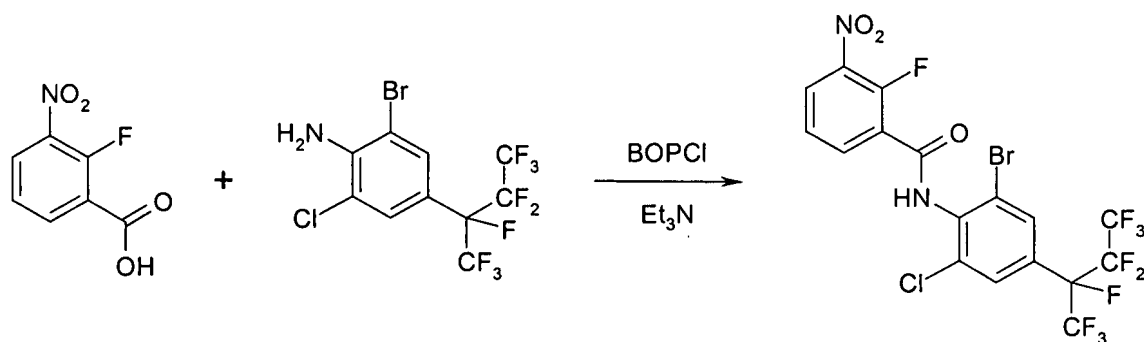
一些混合物可包含具有顯著不同的物理、化學或生物性質之活性成分，致使它們本身不容易適合於相同習用調配物類型。在這些狀況下，可製備其他的調配物類型。例如，其中一種活性成分為水不溶性固體和其他為水不溶性

液體，然而其可能藉由將固體活性成分分散成懸浮液(使用類似於 SC 之製備的製備)，但將液態活性成分分散成乳液(使用類似於 EW 之製備的製備)而將每種活性成分分散在相同連續水相中。所得組成物為超乳液(SE)調配物。

實施例

下列縮寫係使用於本節中：s = 單峰；bs = 寬單峰；d = 二重峰；dd = 雙二重峰；dt = 雙三重峰；t = 三重峰，tt = 參三重峰，q = 四重峰，sept = 七重峰；m = 多重峰；Me = 甲基；Et = 乙基；Pr = 丙基；Bu = 丁基；M.p. = 熔點；RT = 滯留時間， $M+H^+$ = 分子陽離子(即測得之分子量)。

實施例 I1：N-[2-溴基-6-氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟基-甲基丙基)苯基]-2-氟基-3-硝基苯甲醯胺



將三乙胺(19.7 毫升，141 毫莫耳)和雙(2-側氧基-3-噁唑啉基)磷醯氯("BOP-Cl")(23.98 克，94 毫莫耳)加至 2-溴基-6-氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基-丙基)苯胺(實施例 I6)(20 克，47.1 毫莫耳)和 2-氟基-3-硝基苯甲酸(17.4 克，94.2 毫莫耳)在二氯甲烷(230 毫升)中的溶液。將反應混合物

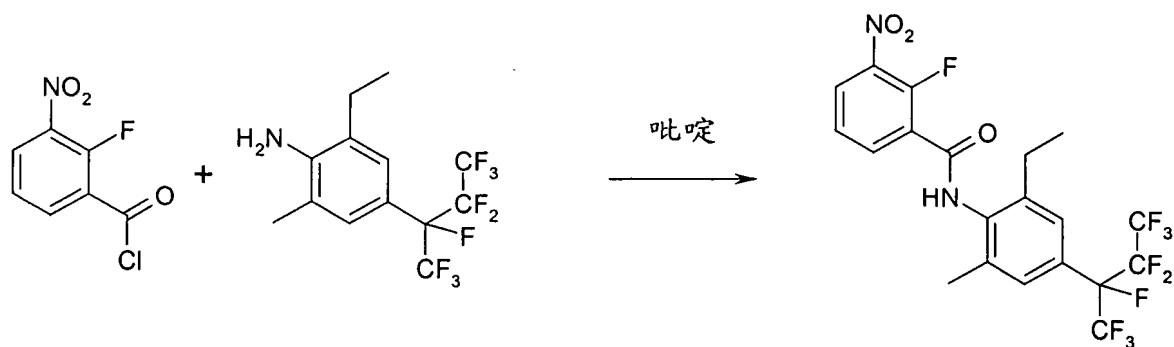
加熱至回流經 6 小時。將反應混合物冷卻至周圍溫度且藉由加入鹽酸水溶液(1N)停止反應。然後用二氯甲烷萃取混合物三次。將合併之有機萃取物用飽和碳酸氫鈉水溶液萃取，經過硫酸鈉乾燥和濃縮。藉由管柱層析法在矽膠上純化殘餘物(溶析液：環己烷/乙酸乙酯 7：3)以產生 *N*-[2-溴基-6-氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)苯基]-2-氟基-3-硝基苯甲醯胺(12 克，43%產率)。¹H NMR (CDCl₃，400 MHz)：8.48 (t，1H)，8.30 (t，1H)，8.18 (db，1H)，7.86 (s，1H)，7.75 (s，1 H)，7.54 (t，1H) ppm。

下列化合物係藉由相同程序製造：

N-[2,6-二氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)苯基]-2-氟基-3-硝基-苯甲醯胺

¹H NMR (CDCl₃，400 MHz)：8.48 (t，1H)，8.28 (t，1H)，8.14 (db，1H)，7.68 (s，2H)，7.54 (t，1H) ppm。

實施例 12：*N*-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基-苯基]-2-氟基-3-硝基苯甲醯胺

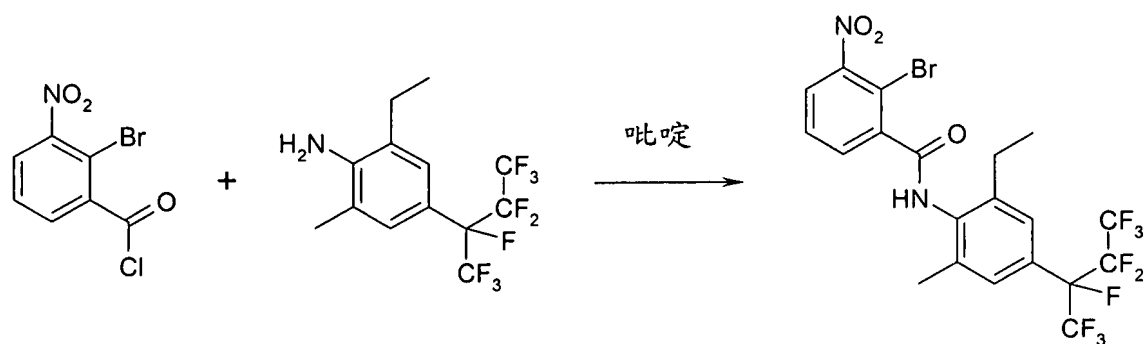


在周圍溫度下將草醯氯(4.3 毫升)，接著 *N,N*-二甲基甲醯胺(0.2 毫升)加至 2-氟基-3-硝基苯甲酸(6.3 克，34 毫莫耳)在二氯甲烷(20 毫升)中的懸浮液。將反應混合物在周圍溫

度下攪拌 1 小時，然後加熱至回流經 3 小時。使反應混合物冷卻至周圍溫度，然後濃縮。將殘餘物懸浮在四氫呋喃(50 毫升)中。將 2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基苯胺(如 WO 08/074427 中所述製備)(10 克，28.3 毫莫耳)溶解在四氫呋喃(50 毫升)中並添加吡啶(6.8 毫升，84.9 毫莫耳)。將反應混合物在周圍溫度下攪拌 3 小時，然後於回流下攪拌經 3 小時。藉由添加飽和碳酸氫鈉水溶液(100 毫升)使反應停止且用乙酸乙酯(2x 200 毫升)萃取混合物二次。將合併之有機萃取物經過硫酸鈉乾燥和濃縮。藉由管柱層析法在矽膠上純化殘餘物(溶析液：環己烷/乙酸乙酯 4：1 至 0：1)以產生 *N*-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基苯基]-2-氟基-3-硝基苯甲醯胺(6.32 克，43%產率)。

^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz): 8.34 (m, 1H), 8.22 (m, 1H), 8.02 (bs, 1H), 7.45 (t, 1H), 7.48 (s, 2H), 2.70 (q, 2H), 1.22 (t, 3H)。

實施例 I3: *N*-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基-苯基]-2-溴基-3-硝基苯甲醯胺



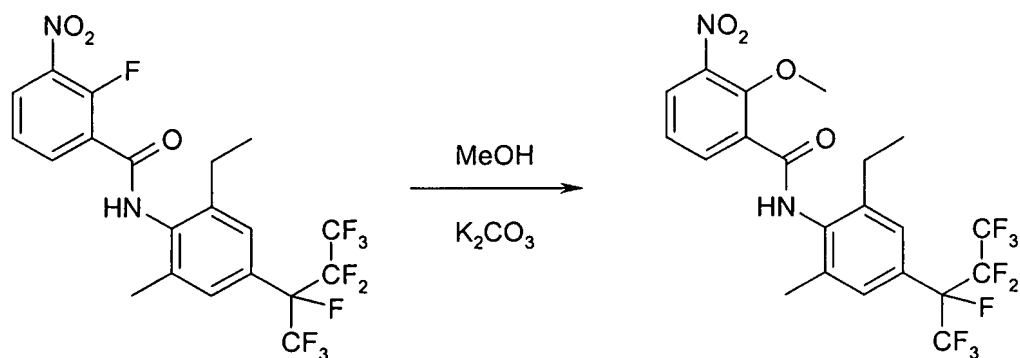
在周圍溫度下將 *N,N*-二甲基甲醯胺(90 微升)加至 2-溴

基-3-硝基苯甲酸(2.870 克, 0.0117 莫耳)在甲苯(29 毫升)中的懸浮液, 接著慢慢地加入亞硫醯氯(1.69 毫升, 0.02332 莫耳)。將反應混合物在 100°C 下攪拌 1 小時。使反應混合物冷卻至周圍溫度並蒸發甲苯。將適當量的醯基氯溶解在 THF 中且沒有額外純化即使用。

在 0 至 5°C 下將吡啶 (72.6 微升, 0.9 毫莫耳)加至 2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基苯胺(如 WO 08/074427 中所述製備)(106 毫克, 0.3 毫莫耳)在四氫呋喃(0.5 毫升)中的溶液。添加 2-溴基-3-硝基苯甲醯氯(87 毫克, 0.33 毫莫耳)在四氫呋喃(0.5 毫升)中的溶液。將反應混合物在周圍溫度下攪拌 3 小時, 然後在回流下攪拌 15 小時。在 15 小時之後, 反應不完全, 所以加入 *N,N*-二甲基乙醯胺("DMA")(0.1 當量)和更多 2-溴基-3-硝基苯甲醯氯(0.2 當量)。將反應混合物在周圍溫度下攪拌 41 小時。在 41 小時之後, 反應藉由加入飽和碳酸氫鈉水溶液(10 毫升)停止反應並用乙酸乙酯(2x 20 毫升)萃取混合物二次。將合併之有機萃取物經過硫酸鈉乾燥和濃縮。藉由管柱層析法在矽膠上純化殘餘物(溶析液: 環己烷/乙酸乙酯 6: 1)以產生 *N*-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基苯基]-2-溴基-3-硝基苯甲醯胺(0.133 克, 76%產率)。

¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz): 7.78 (dd, 1H), 7.72 (dd, 1H), 7.53 (t, 1H), 7.32 (s, 2H), 7.17 (bs, 1H), 2.71 (q, 2H), 2.40 (s, 3H), 1.19 (t, 3H)。

實施例 I4: *N*-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基-苯基]-2-甲氧基-3-硝基苯甲醯胺



在周圍溫度下將碳酸鉀(2.6 克，16.2 毫莫耳)加至 *N*-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基苯基]-2-氟基-3-硝基苯甲醯胺(實施例 I2)(5 克，9.6 毫莫耳)在甲醇(195 毫升)中的懸浮液。將反應混合物在周圍溫度下攪拌 16 小時。濃縮反應混合物且將殘餘物溶解在二氯甲烷中。將有機相用水洗滌，經過硫酸鈉乾燥和濃縮。藉由管柱層析法在矽膠上純化殘餘物(溶析液：環己烷/乙酸乙酯 3：1)以產生 *N*-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基苯基]-2-甲氧基-3-硝基苯甲醯胺(5.1 克，99%產率)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 8.90 (bs, 1H), 8.32 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.38 (m, 3H), 4.19 (s, 3H), 2.70 (q, 2H), 2.24 (s, 3H), 1.20 (t, 3H) ppm。

下列化合物係藉由相同程序製造：

N-[2-溴基-6-氟基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)苯基]-2-甲氧基-3-硝基苯甲醯胺

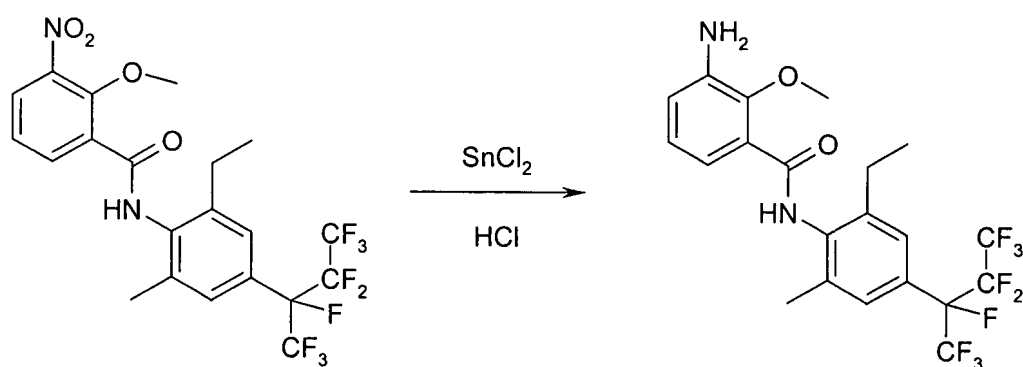
¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 9.23 (bs, 1H), 8.45 (dd, 1H), 8.07 (dd, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.71 (s, 1H), 7.46 (t, 1H), 4.18 (s, 3H) ppm。

N-[2,6-二氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)苯基]-2-甲氧基-3-硝基苯甲醯胺

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 9.22 (bs, 1H), 8.42 (d, 1H), 8.07 (d, 1H), 7.68 (s, 2H), 7.44 (t, 1H), 4.15 (s, 3H) ppm。

相似的程序應用於 *N*-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基苯基]-2-溴基-3-硝基苯甲醯胺(實施例 I3)以產生 *N*-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基苯基]-2-甲氧基-3-硝基苯甲醯胺(92%產率)。

實施例 I5: 3-胺基-*N*-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基苯基]-2-甲氧基苯甲醯胺



在周圍溫度下將氯化錫(6.5 克, 34.5 毫莫耳)加至 *N*-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基苯基]-2-甲氧基-3-硝基苯甲醯胺(實施例 I4) (5.1 克, 9.57 毫莫耳)在異丙醇(50 毫升)中的溶液。將混合物冷卻至 0°C 並慢慢地添加濃鹽酸水溶液(10 毫升)。將反應混合物在 80°C 下攪拌 0.5 小時。蒸發三分之一的異丙醇總體積。將水(100 毫升)加至濃縮混合物中且添加氫氧化鈉水溶液(4N)以將

pH 調整至 7 到 8。用乙酸乙酯萃取水相三次(3x 200 毫升)。將合併之有機萃取物經過硫酸鈉乾燥和濃縮。藉由管柱層析法在矽膠上純化殘餘物(溶析液：環己烷/乙酸乙酯 2：1 至 1：1)以產生 3-胺基-*N*-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基苯基]-2-甲氧基苯甲醯胺(2.3 克，48% 產率)。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 9.12 (bs, 1H), 7.37 (dd, 1H), 7.26 (s, 2H), 6.91 (t, 1H), 6.80 (dd, 1H), 3.90 (bs, 2H), 3.80 (s, 3H), 2.60 (q, 2H), 2.24 (s, 3H), 1.11 (t, 3H) ppm。

下列化合物係藉由相同程序製造：

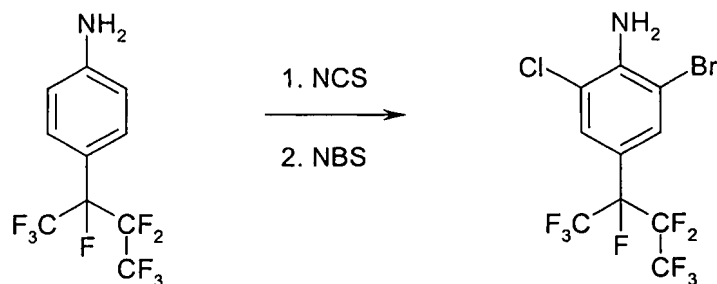
3-胺基-*N*-[2-溴基-6-氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-苯基]-2-甲氧基苯甲醯胺

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 7.73 (bs, 1H), 7.61 (s, 1H), 7.47 (dd, 1H), 6.98 (t, 1H), 6.88 (dd, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.85 (bs, 2H) ppm。

3-胺基-*N*-[2,6-二氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-苯基]-2-甲氧基苯甲醯胺

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 7.65 (s, 2H), 7.54 (d, 1H), 7.10 (t, 1H), 6.98 (d, 1H), 3.98 (s, 3H), 3.93 (bs, 2H) ppm。

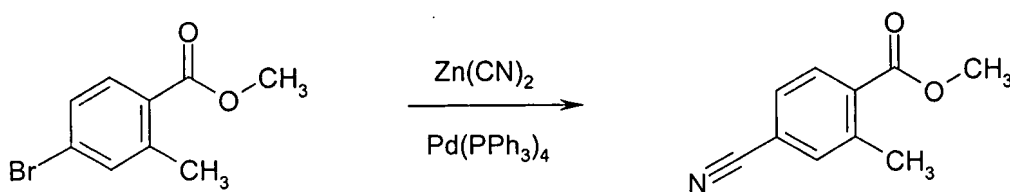
實施例 I6: 2-溴基-6-氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-苯胺



將 4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基乙基)苯胺(根據 EP 1,006,102 製備)(175.8 克, 565 毫莫耳)溶解在乙腈(1000 毫升)中及添加 *N*-氯基-琥珀醯亞胺("NCS")(76.2 克, 570.7 毫莫耳)。將反應混合物加熱至回流經 90 分鐘。在真空下濃縮反應混合物, 將殘餘物懸浮在二乙醚中並經由過濾除去固體。濃縮濾液並藉由管柱層析法在矽膠上純化殘餘物(溶析液: 環己烷/二氯甲烷 9:1)以產生 2-氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)苯胺。使用 *N*-溴琥珀醯亞胺("NBS")(100.5 克, 565 毫莫耳)作為試劑重複相同程序。此次藉由管柱層析法在矽膠上純化殘餘物(溶析液: 環己烷/二氯甲烷 2:1)以產生 2-溴基-6-氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)苯胺(143.3 克, 59.7%產率)。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 7.70 (s, 1H), 7.42 (s, 1H), 4.82 (s, 2H) ppm。

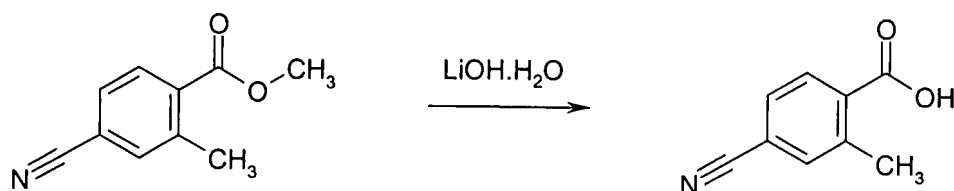
實施例 17: 4-氯基-2-甲基苯甲酸甲酯



在氮氬圍下將氰化鋅(II)(88.5 克, 753.6 毫莫耳)和肆(三苯基膦)鈀(65 克, 56.60 毫莫耳)加至 4-溴基-2-甲基苯甲酸

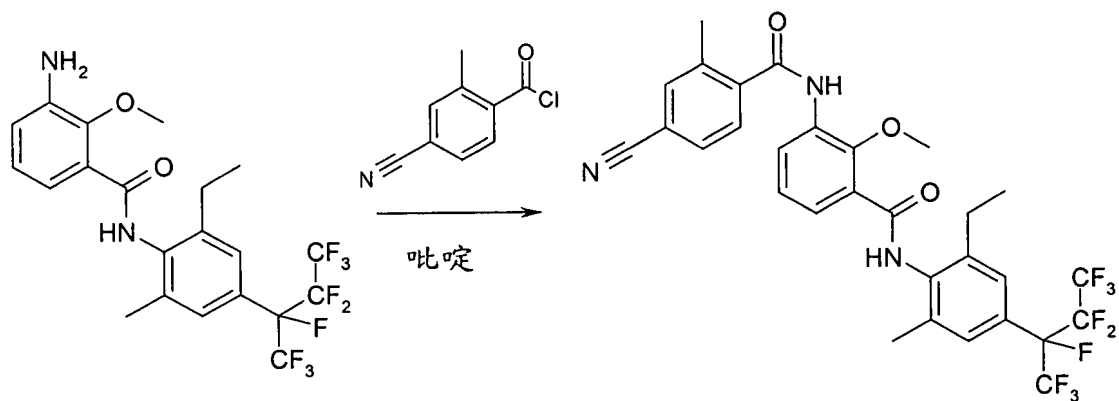
(108 克, 471 毫莫耳) 在 *N,N*-二甲基甲醯胺 (4 升) 中的溶液。將反應混合物在 100°C 下攪拌 16 小時。用甲苯稀釋反應混合物且分離該等相。用甲苯將水相萃取二次。將合併之有機相用鹽水和飽和氫氧化銨水溶液洗滌, 經過硫酸鈉乾燥和濃縮。藉由管柱層析法在矽膠上純化殘餘物 (溶析液: 乙酸乙酯/環己烷 1:5) 以產生 4-氰基-2-甲基苯甲酸甲酯 (73 克, 89% 產率)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 7.78 (d, 1H), 7.52 (m, 2H), 3.92 (s, 3H), 2.62 (s, 3H) ppm。

實施例 I8: 4-氰基-2-甲基苯甲酸



將氫氧化鋰水合物 (31.4 克, 748.2 毫莫耳) 加至 4-氰基-2-甲基苯甲酸 (實施例 17) (61 克, 348 毫莫耳) 在水 (0.360 毫升) 和四氫呋喃 (1.4 升) 的混合物中之溶液。將反應混合物在周圍溫度下攪拌 3 小時。濃縮反應混合物。藉由加入鹽酸水溶液 (1N) 酸化殘餘物並用甲醇和氯仿 (5:95) 的混合物萃取。將有機相經過硫酸鈉乾燥和濃縮。在乙酸乙酯和環己烷的混合物中結晶殘餘物以產生 4-氰基-2-甲基苯甲酸 (55.5 克, 99% 產率)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 7.89 (d, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.72 (d, 1H), 2.51 (s, 3H) ppm。

實施例 P1: *N*-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基-苯基]-3-(4-氰基-2-甲基苯甲醯胺基)-2-甲氧基苯甲醯胺 (表 A 之化合物編號 A5)



在氮氬圍下將草醯氯(0.074 毫升，0.88 毫莫耳)加至 4-氰基-2-甲基苯甲酸(實施例 I8)(0.141 克，0.8 毫莫耳)和 *N,N*-二甲基甲醯胺(2 滴)在二氯甲烷(5 毫升)中的溶液。將反應混合物在周圍溫度下攪拌一小時和然後在 60°C 下攪拌 1.5 小時。濃縮反應混合物且將殘餘物溶解在四氫呋喃(10 毫升)中。將溶液逐滴加至 3-胺基-*N*-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基-丙基)-6-甲基苯基]-2-甲氧基苯甲醯胺(實施例 I5)(0.37 克，0.73 毫莫耳)和吡啶(0.12 毫升，1.46 毫莫耳)在四氫呋喃(10 毫升)中的溶液。將反應混合物在周圍溫度下攪拌 16 小時。將反應混合物倒進碳酸氫鈉水溶液(1M)中並用乙酸乙酯將混合物萃取三次。將合併之有機相經過硫酸鈉乾燥和濃縮。藉由管柱層析法在矽膠上純化殘餘物(溶析液：乙酸乙酯/環己烷 1：3)以產生表 A 之化合物編號 A5 (0.240 克，51%產率)。M.p. 104-105°C。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 8.68 (d, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.92 (d, 1H), 7.66 (m, 3H), 7.41 (m, 3H), 4.00 (s, 3H), 2.72 (q, 2H), 2.62 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.25 (t, 3H) ppm。

下列化合物係藉由相同程序製造：

N-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基苯基]-3-(4-氟基-2-氯苯甲醯胺基)-2-甲氧基苯甲醯胺 (表 A 之化合物編號 A3)

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 8.76 (m, 2H), 8.71 (d, 1H), 7.98 (m, 1H), 7.71 (dd, 1H), 7.39 (m, 3H), 7.27 (dd, 1H), 7.18 (m, 1H), 4.03 (s, 3H), 2.73 (q, 2H), 2.39 (s, 3H), 1.25 (t, 3H) ppm。

N-[2-溴基-6-氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)苯基]-3-(4-氟基-2-氯苯甲醯胺基)-2-甲氧基苯甲醯胺 (表 B 之化合物編號 B2)

M.p. 178-179°C。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 9.12 (bs, 1H), 8.79 (bs, 1H), 8.73 (d, 1H), 7.79-7.72 (m, 2H), 7.84 (s, 1H), 7.72 (s, 1H), 7.38 (t, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.17 (m, 1H), 4.07 (s, 3H) ppm。

N-[2-溴基-6-氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-苯基]-3-(4-氟基-2-甲基苯甲醯胺基)-2-甲氧基苯甲醯胺 (表 B 之化合物編號 B1)

M.p. 109-110°C。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 9.04 (bs, 1H), 8.69 (d, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.93 (dd, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.72 (s, 1H), 7.63 (m, 3H), 7.40 (t, 1H), 4.04 (s, 3H), 2.61 (s, 3H) ppm。

N-[2,6-二氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)苯基]-3-(4-氟基-2-氯苯甲醯胺基)-2-甲氧基苯甲醯胺 (表 C 之化合物編號 C1)

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 9.12 (bs, 1H), 8.79-8.72

(m, 2H), 7.97 (m, 1H), 7.91 (dd, 1H), 7.68 (s, 2H), 7.48 (t, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.16 (m, 1H), 4.04 (s, 3H) ppm。

N-[2,6-二氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)苯基]-3-(4-氟基-2-甲基苯甲醯胺基)-2-甲氧基苯甲醯胺(表 C 之化合物編號 C2)

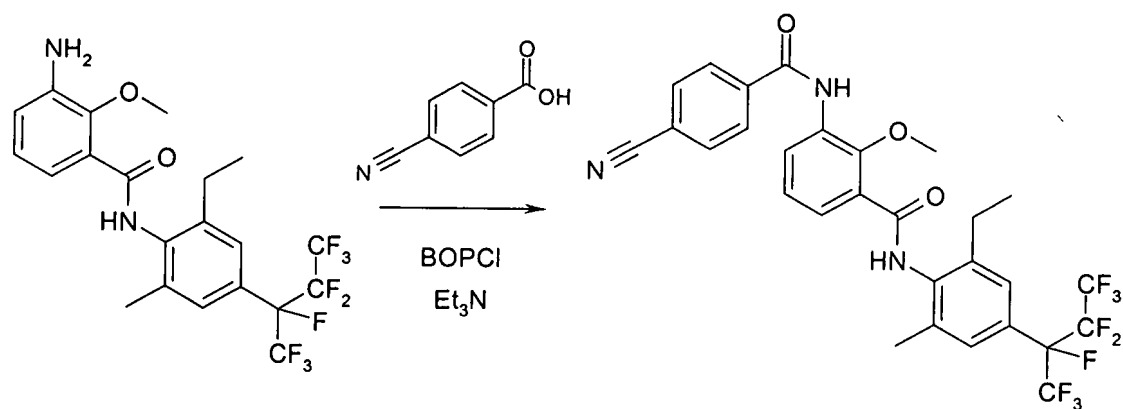
¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 8.99 (bs, 1H), 8.70 (d, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.92 (dd, 1H), 7.68 (s, 2H), 7.62 (s, 3H), 7.40 (t, 1H), 4.02 (s, 3H), 2.60 (s, 3H) ppm。

下列化合物係藉由相同程序製造，除了直接地使用醯基氯和使用三乙胺取代吡啶以外：

N-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基苯基]-3-(4-氟苯甲醯胺基)-2-甲氧基苯甲醯胺(表 A 之化合物編號 A1)

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 8.68 (s, 1H), 8.57 (d, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.89 (m, 2H), 7.80 (dd, 1H), 7.30 (m, 3H), 7.17 (m, 2H), 3.94 (s, 3H), 2.66 (q, 2H), 2.32 (s, 3H), 1.15 (t, 3H)。

實施例 P2：*N*-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基-苯基]-3-(4-氟基苯甲醯胺基)-2-甲氧基苯甲醯胺



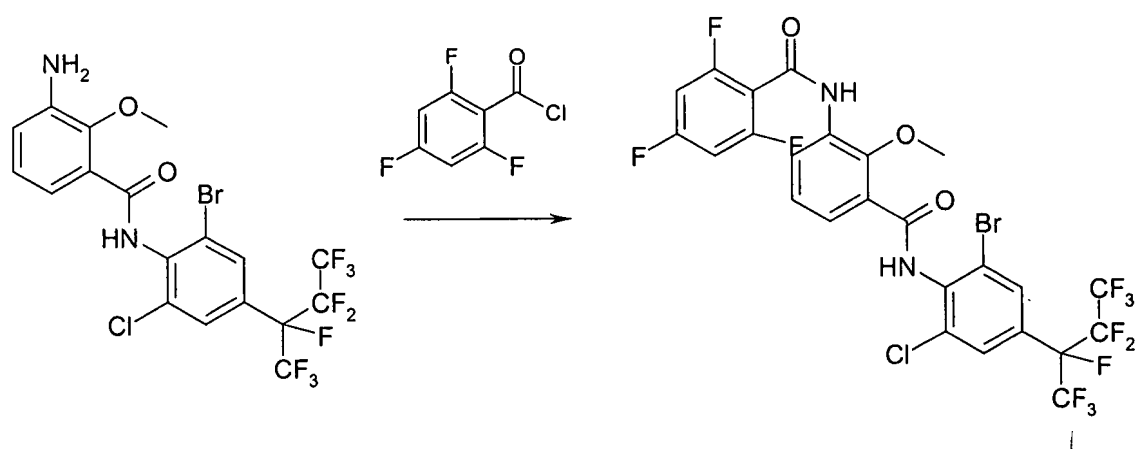
將三乙胺(25 微升, 0.18 毫莫耳)加至 3-胺基-*N*-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基-丙基)-6-甲基苯基]-2-甲氧基苯甲醯胺(實施例 I5)(30 毫克, 0.06 毫莫耳)在四氫呋喃(1.2 毫升)中的溶液。添加 4-氰基苯甲酸(17.6 毫克, 0.12 毫莫耳)和雙(2-側氧基-3-𪗇唑啉基)磷醯氯("BOP-Cl")(30.4 毫克, 0.12 毫莫耳)。將反應混合物加熱至回流經 6 小時。將反應混合物冷卻至周圍溫度及濃縮。將殘餘物溶解在二氯甲烷中並用鹽酸水溶液(1N)和用碳酸氫鈉水溶液(飽和)洗滌。將有機萃取物經過硫酸鈉乾燥和濃縮。藉由管柱層析法在矽膠上純化殘餘物(溶析液: 環己烷/乙酸乙酯 5:3)以產生表 A 之化合物編號 A4(35 毫克, 93%產率)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 8.56 (m, 2H), 8.48 (bs, 1H), 7.97 (m, 2H), 7.82 (d, 1H), 7.78 (d, 2H), 7.30 (m, 3H), 3.94 (s, 3H), 2.65 (q, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.13 (t, 3H) ppm。

下列化合物係藉由相同程序製造:

N-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基苯基]-3-(2-甲基-3-硝基苯甲醯胺基)-2-甲氧基苯甲醯胺(表 A 之化合物編號 A2)

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 8.62 (d, 1H), 8.53 (s, 1H), 7.91 (m, 2H), 7.86 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.42 (t, 1H), 7.30 (m, 3H), 3.91 (s, 3H), 2.64 (q, 2H), 2.59 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.14 (t, 3H) ppm。

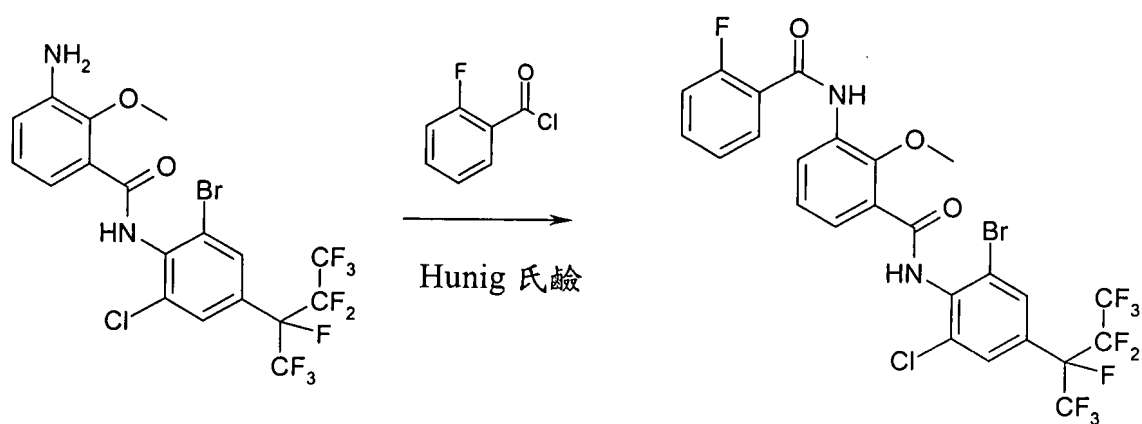
實施例 P3: *N*-{3-[2-溴基-6-氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-苯胺甲醯基]-2-甲氧基苯基}-2,4,6-三氟苯甲醯胺



在氮氛圍下將草醯氯(4.55 毫升, 53.76 毫莫耳)加至 2,4,6-三氟苯甲酸(8.114 克, 46.08 毫莫耳)和 *N,N*-二甲基甲醯胺(數滴)在二氯甲烷(50 毫升)中的溶液。將反應混合物在周圍溫度下攪拌一小時且然後在 60°C 下攪拌 1.5 小時。濃縮反應混合物並將殘餘物溶解在四氫呋喃(200 毫升)中。將溶液逐滴添加至 3-胺基-*N*-[2-溴基-6-氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)苯基]-2-甲氧基苯甲醯胺(實施例 15)(22.03 克, 38.40 毫莫耳)和吡啶(6.18 毫升, 76.80 毫莫耳)在四氫呋喃(200 毫升)中的溶液。將反應混合物在周圍溫度下攪拌 2 小時。將反應混合物倒進碳酸氫鈉(1M)水溶液中並用乙酸乙酯將混合物萃取三次。將合併之有機相經過

硫酸鈉乾燥和濃縮。藉由在矽膠上過濾來純化殘餘物以產生表 B 之化合物編號 B189(28.0 克, 99%產率)。M.p. 179 °C。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 9.14 (s, 1H), 8.72 (d, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.97 (q, 1H), 7.85 (s, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.41 (t, 1H), 6.88 (t, 1H), 4.08 (s, 3H) ppm。

實施例 P4: 從醯氯類製備苯甲醯胺類, 其可以平行合成

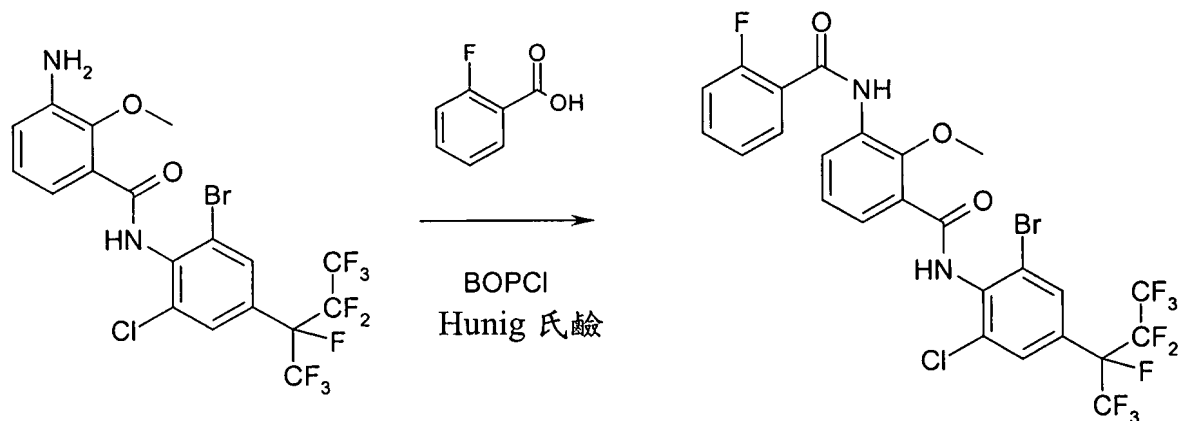


溶液 A 係藉由將胺基衍生物(0.78 毫莫耳)(例如 3-胺基-N-[2-氯基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-溴苯基]-2-甲氧基苯甲醯胺(實施例 I5), 在表 B 之化合物編號 B3 的情形中)溶解在甲苯(15.6 毫升)中而製備。溶液 B 係藉由將醯氯(45 微莫耳))(例如 2-氟苯甲醯氯, 在表 B 之化合物編號 B3 的情形中)溶解在甲苯(0.36 毫升)中而製備。將溶液 A(0.6 毫升, 30 微莫耳)放置於孔中並將溶液 B(0.36 毫升, 45 微莫耳)和二異丙基乙胺(「Hunig 氏鹼」)(30 微升, 150 微莫耳)連續地加至該孔。將反應混合物在 80°C 下攪拌 16 小時。蒸發溶劑且將混合物用乙腈(0.6 毫升)和 N,N-二甲基乙醯胺(0.2 毫升)的混合物稀釋, 然後用 HPLC 純化以產生

所要化合物。

此方法用以平行地製備許多化合物。

實施例 P5：從羧酸類製備苯甲醯胺，其可以平行合成



溶液 A 係藉由將胺基衍生物(0.65 毫莫耳)(例如 3-胺基-N-[2-乙基-4-(1,2,2,3,3,3-六氟基-1-三氟甲基丙基)-6-甲基苯基]-2-甲氧基苯甲醯胺(實施例 I5)，在表 A 之化合物編號 A9 的情形中)溶解在 *N,N*-二甲基乙醯胺("DMA")(9.6 毫升)而製備。溶液 B 藉由將羧酸(37.5 微莫耳))(例如 2-氯苯甲酸，在表 A 之化合物編號 A9 的情形中)溶解在 *N,N*-二甲基乙醯胺("DMA")(0.38 毫升)中而製備。溶液 C 藉由將雙(2-側氧基-3-噁唑啉基)磷醯氯("BOP-Cl")(1.95 毫莫耳)溶解在 *N,N*-二甲基乙醯胺("DMA")(7.8 毫升)中而製備。將溶液 A(0.4 毫升，0.025 毫莫耳))放置於孔中，且將溶液 B(0.38 毫升，37.5 微莫耳)、溶液 C(0.2 毫升，50 微莫耳)和二異丙基乙胺(「Hunig 氏鹼」)(40 微升，200 微莫耳)連續地加至該孔。將反應混合物在 100°C 下攪拌 16 小時。蒸發溶劑且將混合物用乙腈(0.6 毫升)和 *N,N*-二甲基乙醯胺(0.2 毫升)的混合物稀釋，然後用 HPLC 純化以產生所要化合物。

此方法用以平行地製備許多化合物。

下列 HPLC-MS 方法係用於分析表 A 至 L 之化合物：

方法 1：

MS	來自 Waters 之 ZQ 質譜儀(單四極質譜儀)，離子化法：電噴灑，極性：正離子化，毛細管(kV)3.00，錐(V)30.00，萃取器(V)3.00，來源溫度(°C)100，去溶(desolvation)溫度(°C)200，錐氣體流速(升/小時)200，去溶氣體流速(升/小時)250，質量範圍：150 至 800 Da。			
LC	來自 Agilent 之 1100er 系列 HPLC：四元泵，加熱管柱室和二極管陣列檢測器。 管柱：Waters Atlantis dc18；長度：20 毫米；內徑：3 毫米；粒徑：3 微米，溫度(°C) 40，DAD 波長範圍(奈米)：200 至 500，溶劑梯度：A = 在水中之 0.1% 甲酸和 B：在乙腈中之 0.1% 甲酸。			
	時間(分鐘)	A%	B%	流速(毫升/分鐘)
	0.0	80	20	1.7
	2.5	0.0	100	1.7
	2.8	0.0	100	1.7
	2.9	80	20	1.7

方法 2：

MS	來自 Waters 之 ZQ 質譜儀(單四極質譜儀)，離子化法：電噴灑，極性：正離子化，毛細管(kV)3.00，錐(V)30.00，萃取器(V)3.00，來源溫度(°C)100，去溶溫度(°C)200，錐氣體流速(升/小時)200，去溶氣體流速(升/小時) 250，質量範圍：150 至 800 Da。			
LC	來自 Agilent 之 1100er 系列 HPLC：四元泵，加熱管柱室和二極管陣列檢測器。 管柱：Waters Atlantis dc18；長度：20 毫米；內徑：3 毫米；粒徑：3 微米，溫度(°C)40，DAD 波長範圍(奈米)：200 至 500，溶劑梯度：A=在水中之 0.1% 甲酸和 B: 在乙腈中之 0.1% 甲酸。			
	時間(分鐘)	A%	B%	流速(毫升/分鐘)
	0.0	90	10	1.7
	5.5	0.0	100	1.7
	5.8	0.0	100	1.7
	5.9	90	10	1.7

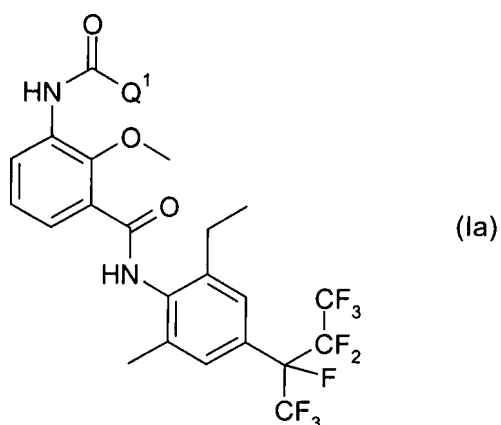
方法 3：

MS	來自 Waters 之 ZQ 質譜儀(單四極質譜儀)， 儀器參數：離子化法：電噴灑。極性：負離子 毛細管(kV)3.00，錐(V)30.00，萃取器(V)2.00，來源溫度(°C)100，去溶溫度(°C)250，錐氣體流速(升/小時)50，去溶氣體流速(升/小時)400，質量範圍：150 至 1000 Da。			
LC	來自 Agilent 之 HP 1100 HPLC：溶劑除氣器，四元泵(ZCQ)/二元泵(ZDQ)，加熱管柱室和二極管陣列檢測器。 管柱：Phenomenex Gemini C18，3 微米粒徑，110 埃，30 x 3 毫米，溫度：60 °C。DAD 波長範圍(奈米)：200 至 500，溶劑梯度：A=水+0.05% HCOOH。B=乙腈/甲醇(4：1，體積：體積)+0.04% HCOOH			
	時間(分鐘)	A%	B%	流速(毫升/分鐘)
	0.00	95.0	5.0	1.7
	2.00	0.00	100.00	1.7
	2.80	0.00	100.00	1.7
	2.90	95.0	5.0	1.7
	3.00	95.0	5.0	1.7

方法 4：

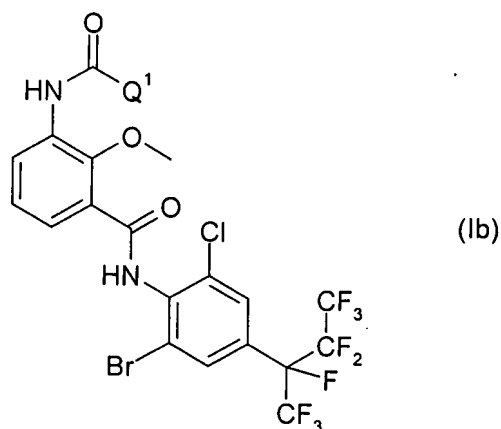
MS	來自 Waters 之 ZQ 質譜儀(單四極質譜儀)， 儀器參數：離子化法：電噴灑。極性：負離子 毛細管(kV)3.00，錐(V) 30.00，萃取器(V) 2.00，來源溫度(°C)100，去溶溫度(°C) 250，錐氣體流速(升/小時) 50，去溶氣體流速(升/小時) 400。質量範圍：100 至 900 Da。			
LC	來自 Agilent 之 HP 1100 HPLC：溶劑除氣器，四元泵(ZCQ)/二元泵(ZDQ)，加熱管柱室和二極管陣列檢測器。 管柱：Phenomenex Gemini C18，3 微米粒徑：110 埃，30 x 3 毫米，溫度(°C)60 °C。DAD 波長範圍(奈米)：200 至 500，溶劑梯度：A=水+0.05 % HCOO，B=乙腈/甲醇(4：1，體積：體積)+0.04% HCOOH			
	時間(分鐘)	A%	B%	流速(毫升/分鐘)
	0.00	95.0	5.0	1.7
	2.00	0.00	100.00	1.7
	2.80	0.00	100.00	1.7
	2.90	95.0	5.0	1.7
	3.00	95.0	5.0	1.7

表 A :



化合物 編號	Q ¹	RT (分鐘)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS 方法
A1	4-氟苯基	3.87	624.8		2
A2	2-甲基-3-硝基苯基	-	-		
A3	2-氯基-4-氟苯基	-	-		
A4	4-氟基苯基	3.77	631.9		2
A5	4-氟基-2-甲基苯基	-	-	104	
A6	2-氯吡啶-3-基	3.65	641.8		2
A7	2-氟吡啶-3-基	3.79	625.8		2
A8	3-氯苯基	4.04	640.8		2
A9	2-氯苯基	3.94	640.8		2
A10	2-氯吡啶-4-基	3.76	641.8		2
A11	5-溴吡啶-3-基	3.75	687.7		2
A12	5-溴呋喃-2-基	3.98	676.7		2
A13	2-溴苯基	3.94	686.7		2
A14	3-氯基-5-三氟甲基吡啶-2-基	4.3	709.8		2
A15	2-氟基-3-三氟甲基苯基	4.24	692.8		2
A16	2,5-二氯苯基	4.13	674.8		2
A17	6-氯吡啶-3-基	3.67	641.8		2
A18	4-硝基苯基	3.86	651.8		2
A19	苯基	3.84	606.8		2
A20	2,3-二氟苯基	4.07	642.8		2
A21	5-氯噻吩-2-基	4.07	646.8		2
A22	2-甲基-4-硝基苯基			175	

表 B :



化合物 編號	Q ¹	RT (分鐘)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS 方法
B1	4-氟基-2-甲基苯基	-	-		
B2	2-氯基-4-氟苯基	2.2	730.7		1
B3	4-氟苯基	2.23	696.6		1
B4	2-甲基苯基	2.17	692.7		1
B5	2-氯苯基	2.18	712.7		1
B6	4-氟基苯基	2.07	703.7		1
B7	4-硝基苯基	2.06	722.0		1
B8	4-甲基苯基	2.21	692.7		1
B9	4-氟基-3-甲基苯基	2.18	710.7		1
B10	5-氯基-2-氟苯基	2.34	730.6		1
B11	2-氯基-4-硝基苯基	2.19	757.7		1
B12	呋喃-2-基	2.06	668.7		1
B13	4-三氟甲氧基苯基	2.29	762.7		1
B14	4-氟基-3-三氟-甲基苯基	2.27	764.7		1
B15	4-三氟甲基苯基	2.05	746.7		1
B16	2-三氟甲氧基苯基	2.26	762.7		1
B17	2-甲氧基苯基	2.28	708.7		1
B18	苯基	2.12	678.6		1
B19	4-氟苯基	2.13	696.7		1
B20	2-三氟甲基苯基	2.17	746.7		1
B21	4-甲基-1,2,3-噁二唑-5-基	2.05	700.6		1
B22	2,3-二氟苯基	2.25	714.7		1
B23	2,4-二氟苯基	2.26	714.7		1
B24	2-氟基-5-三氟甲基苯基	2.34	764.7		1
B25	4-異丙基苯基	4.55	719.07		2
B26	4-甲硫基苯基	4.27	722.99		2
B27	2,5-二氯苯基	4.44	744.97		2
B28	4-甲氧基苯基	4.1	707		2
B29	2,4,5-三氟基-3-氯苯基	4.59	764.98		2
B30	4-(吡咯-1-基)苯基	4.35	742.06		2
B31	4-(1,2,3-噁二唑-4-基)苯基	4.18	761.02		2

化合物 編號	Q ¹	RT (分鐘)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS 方法
B32	(3,4-二氫-2H-苯并[b][1,4] 二氧呋)-7-基	4.16	749.06		2
B33	4-聯苯基	4.54	753.08		2
B34	3-甲基吡啶-2-基	4.55	692		2
B35	2-氟基-3-三氟甲基苯基	4.49	763		2
B36	2-溴苯基	4.18	754.94		2
B37	吡啶-3-基	3.57	677.98		2
B38	4-甲氧基噻吩-3-基	4.41	712.99		2
B39	1,2,3-噻二唑-4-基	4.07	684.96		2
B41	5-苯基噁唑-4-基	4.76	744.05		2
B42	2,5-二甲基-2H-吡唑-3-基	3.91	695.04		2
B43	4-甲基-2-苯基嘧啶-5-基	4.41	769.07		2
B44	噻吩-2-基	4.07	682.96		2
B45	2-甲基硫基吡啶-3-基	4.1	723.99		2
B46	5-甲基-3-苯基異噁唑-4-基	4.39	758.06		2
B47	4-甲基-2-苯基噻唑-5-基	4.6	774.06		2
B48	5-吡啶-2-基噻吩-2-基	4.22	760.02		2
B49	5-苯基呋喃-2-基	4.54	743.02		2
B50	5-甲基-1-苯基-1H-吡唑-4-基	4.17	757.06		2
B51	6-嗎啉-4-基-吡啶-2-基	4.03	763.92		2
B52	5-溴呋喃-2-基	4.26	744.84		2
B53	吡啶-2-基	4.46	677.9		2
B54	吡啶-4-基	3.57	677.9		2
B55	N-側氧基吡啶-3-基	3.23	693.91		2
B56	吡啶-2-基	4.03	678.91		2
B57	3-溴噻吩-2-基	4.84	760.8		2
B58	2,5-二甲基呋喃-3-基	4.29	694.91		2
B61	5-硝基呋喃-2-基	4.03	711.88		2
B62	2-氟基-5-硝基苯基	4.29	755.9		2
B63	2,5-二甲基呋喃-3-基	4.36	775.84		2
B64	2-硝基-4-氟苯基	4.26	755.91		2
B65	3-甲基-4-溴苯基	4.54	768.9		2
B66	3-氟吡啶-4-基	3.87	711.91		2
B67	5-氟噻吩-2-基	4.36	716.85		2
B68	3-氟基-5-碘苯基	4.55	836.84		2
B69	2-甲基-3-硝基苯基	4.11	735.96		2
B70	3-氟基-5-三氟甲基苯基	4.42	778.92		2
B71	嘧啶-2-基	3.76	678.91		2
B72	2-氟基-5-甲基苯基	4.39	724.9		2
B73	2-氟基-4,5-二氟苯基	4.33	746.88		2
B74	2-硝基-5-甲基苯基	4.13	735.94		2
B75	2,6-二氟基-5-氟吡啶-3-基	4.37	763.86		2
B76	4-溴基-2-乙基-5-甲基-2H- 吡唑-3-基	4.59	786.91		2

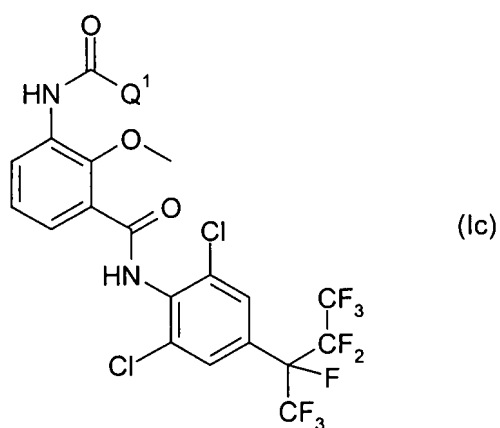
化合物 編號	Q ¹	RT (分鐘)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS 方法
B77	4-氟基-3-硝基苯基	4.13	739.92		2
B78	2-吡啶-3-基噻唑-4-基	4.26	760.91		2
B80	2-硝基苯基	4.04	721.9		2
B81	2-三氟甲基吡啶-3-基	3.97	745.92		2
B82	3-甲基吡啶-4-基	3.45	691.94		2
B83	5-溴基-2-氟苯基	4.52	788.81		2
B84	3-溴基-4-甲基苯基	4.52	768.87		2
B85	2-溴基-3-硝基苯基	4.13	799.85		2
B86	2-甲基-3,5-二硝基苯基	4.24	780.97		2
B87	3-甲基-2-硝基苯基	4.11	735.9		2
B88	3-甲基噻吩-2-基	4.31	696.87		2
B89	3-甲氧基異噻唑-5-基	4.04	697.88		2
B90	6-氟基-1-氧基吡啶-2-基	4.12	727.89		2
B91	2-羥基-3,5-三氟苯基	4.2	760.84		2
B92	1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-3-基	4.46	748.9		2
B93	3-氟基-2-甲基吡啶-4-基	3.98	725.88		2
B94	4-甲基噻唑-5-基	3.85	681.88		2
B95	2-甲氧基甲基-4-甲基噻唑-5-基	4.02	741.93		2
B96	2,4-二甲基噻唑-5-基	3.96	711.91		2
B97	2,6-二氟吡啶-4-基	4.4	745.84		2
B98	3-甲基異噻唑-4-基	3.88	697.88		2
B99	2-甲基-3-羧酸甲酯-4-甲基硫基苯基	4.28	794.94		2
B100	1,5-二甲基-1H-吡唑-3-基	4.15	694.9		2
B101	2-氟基-6-硝基苯基	4.16	755.86		2
B102	4-氟基-2-氟基-5-硝基苯基	4.33	773.92		2
B103	4-氟基-5-二氟甲氧基-1-甲基-1H-吡唑-3-基	4.4	780.87		2
B104	4-甲基-2-三氟甲基噻唑-5-基	4.42	765.87		2
B105	2-氟基-4-甲基噻唑-5-基	4.36	731.83		2
B106	2,3-二氟基-4-(2-甲氧基-乙氧基)苯基	4.38	818.88		2
B107	5-氟基-6-甲基吡啶-2-基	4.45	716.9		2
B108	2-甲烱磺醯基-4-三氟甲基苯基	4.13	822.89		2
B109	2,4-二氟基-3-甲氧基苯基	4.46	774.84		2
B110	3-氟基甲基苯基	3.95	715.89		2
B111	嘧啶-5-基	3.55	678.85		2
B112	5-第三丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基	4.41	736.95		2
B113	2-甲基-5-三氟甲基-2H-吡唑-3-基	4.29	748.9		2
B114	2-氟基-4-甲烱磺醯基-3-甲氧基苯基	4.03	818.87		2

化合物 編號	Q ¹	RT (分鐘)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS 方法
B115	3-氯基-2-三氟甲基-吡啶-4-基	4.3	779.85		2
B116	4-甲基硫基-2-硝基苯基	4.2	767.85		2
B117	3-氯基-1-甲基-1H-吡啶-4-基	3.82	705.98		2
B118	2-(2-氯苯基)-4-三氟甲基-噻唑 -5-基	4.85	861.85		2
B119	4-甲烷磺醯基-3-甲氧基甲基-2- 甲基苯基	3.91	812.93		2
B120	3-[二乙氧基氧磷基(phosphinyl)] 氧基]苯基	4.09	828.93		2
B121	2-異丙基硫基(吡啶-3-基	4.44	751.93		2
B122	2-(3-乙氧基丙基)-6-三氟甲基 -吡啶-3-基	4.48	831.96		2
B123	4'-氯基-4-甲基聯苯基-3-基	4.81	800.91		2
B124	噻吩-3-基	4.02	682.83		2
B125	2-甲基硫基-4-三氟甲基苯基	4.48	790.86		
B126	4-三氟甲基吡啶-5-基	3.96	745.86		2
B127	2-甲基-6-三氟甲基吡啶-3-基	4.19	759.89		2
B128	2,6-二氯菸鹼-3-基	4.31	745.8		2
B129	6-甲氧基-3-溴基-2-甲基苯基	4.49	798.83		2
B130	2-氯基-4-氯基-5-硝基苯基	4.31	773.84		2
B131	3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶 -4-基	3.9	730.88		2
B132	2-甲氧基吡啶-3-基	4.47	707.87		2
B133	4-氯基-2-甲基-5-三氟甲基 -2H-吡啶-3-基	4.64	782.84		2
B134	2-甲基-4-三氟甲基噻唑-5-基	4.19	765.83		2
B135	2-氯基-4-溴苯基	4.55	788.8		2
B136	4-氯基-1-甲基-5-三氟甲基-1H -吡啶-3-基	4.56	782.84		2
B137	5-甲基噻吩-2-基	4.2	696.82		2
B138	4-溴基-2-甲基苯基	4.44	768.8		2
B139	4-溴基-3-甲氧基-2-甲基苯基	4.42	798.83		2
B140	5-第三丁基-2-甲氧基苯基	4.92	762.94		2
B141	3-氯基-5-三氟甲基吡啶-2-基	4.57	779.82		2
B142	5-氯基-1,3-二甲基-1H-吡啶 -4-基	4.14	728.85		2
B143	4,5-二氯異噻唑-3-基	4.63	751.75		2
B144	5-甲基-2-三氟甲基呋喃-3-基	4.36	748.83		2
B145	3-氯噻吩-2-基	4.61	716.78		2
B146	2-氯基-6-甲氧基吡啶-4-基	4.32	741.83		2
B147	5-氯基-4-甲氧基噻吩-3-基	4.62	746.8		2
B148	2-氯基-5-硝基苯基	4.34	739.85		2
B149	3-氯基-2-氯基-6-三氟甲基苯基	4.48	796.81		2

化合物 編號	Q ¹	RT (分鐘)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS 方法
B150	6-二氟甲基-2-甲氧基甲基吡啶-3-基	4.09	771.9		2
B151	2-氟吡啶-4-基	3.88	695.84		2
B152	1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基	4.02	748.85		2
B153	2,5-二氟苯基	4.1	712.93		2
B154	2-氟基-5-氟苯基	4.19	728.91		2
B155	2,4-二氟苯基	4.39	744.89		2
B156	2-甲基-3-氟苯基	4.39	724.89		2
B157	3,5-二甲基-異噁唑-4-基	3.96	695.86		2
B158	2,6-二氟苯基			116	
B159	2-氟基-4-溴基-6-甲基苯基			114	
B160	2-羥基-3,5-二氟苯基			200	
B161	2-碘-3-甲基-4-硝基苯基			175	
B162	2-溴基-3-甲基-4-硝基苯基			172	
B163	2-氟基-3-甲基-4-硝基苯基			127	
B164	2,6-二甲氧基苯基			105	
B165	3,5-二甲基-4-硝基苯基			218	
B166	2-甲氧基-6-氟苯基			112	
B167	2-氟基-4-三氟甲基苯基			183	
B168	3,5-二氟苯基			83	
B169	2,5-二氟苯基			154	
B170	3-氟基-4-硝基苯基			95	
B171	3-乙酸酯基(acetate)-4-硝基苯基			100	
B172	2,6-二氟苯基			177	
B173	3-乙氧基-4-硝基苯基			238	
B174	3-胺基-4-硝基苯基			205	
B175	3-(N,N-二甲胺基)-4-硝基苯基			181	
B176	2,6-二氟基-4-氟基苯基			214	
B177	2-甲氧基-4-硝基苯基			190	
B178	2-三氟甲基-4-硝基苯基			140	
B179	3-三氟甲基-4-硝基苯基			142	
B180	2,4-二硝基苯基			246	
B181	3-羥基-4-硝基苯基			185	
B182	2-氟基-4-甲基苯基			172	
B183	2-氟基-3-硝基苯基			123	
B184	2,3-二氟苯基			136	
B185	3,5-二氟吡啶-2-基			181	
B186	2,5-二氟噻吩-3-基			188	
B187	5-溴嘧啶-2-基			204	
B188	3-三氟甲基吡啶-2-基			175	
B189	2,4,6-三氟苯基			179	
B190	3-甲基-4-硝基苯基			107	
B191	2-氟基-4-硝基苯基			212	

化合物 編號	Q ¹	RT (分鐘)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS 方法
B192	3-氟基-4-硝基苯基			104	
B193	3-硝基苯基			98	
B194	2-氟基-吡啶-3-基			167	
B195	3,4-二硝基苯基			114	
B196	2-甲基-4-硝基苯基			104	
B197	2-氟基-4-硝基苯基			199	
B198	2-氟基-4-氟基苯基			211	
B202	2-氟基-吡啶-3-基	2.05	710		4
B203	2-甲氧基-4-氟基-6-羥基苯基	2.1	599		4
B204	4-氟基-吡啶-3-基	2.04	701		4
B205	3-氟基-4-氟基苯基	2.19	826		3
B206	3-溴基-4-氟基苯基	2.18	778		3
B207	3-甲氧基-4-硝基苯基	2.12	750		4
B208	5-氟基吡啶-2-基			208-210	
B209	4-溴基-2,6-二氟苯基			250	
B210	2,4-二氟嘧啶-5-基			114-115	
B211	2,4-二氟基-6-甲基苯基			113-118	
B212	2-甲基-4-氟基-5-硝基苯基			83-84	
B213	2-甲基-4-氟基-5-硝基苯基			158-161	

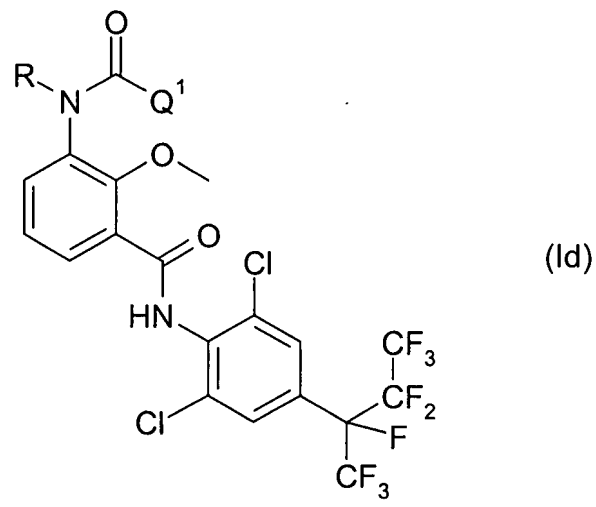
表 C :



化合物 編號	Q ¹	RT (分鐘)	MH ⁺	LC-MS 方法
C1	2-氟基-4-氟苯基	2.19	686.7	1
C2	4-氟基-2-甲基苯基	-	-	
C3	2-氟苯基	2.24	650.8	1

化合物 編號	Q ¹	RT (分鐘)	MH ⁺	LC-MS 方法
C4	2-甲基苯基	2.16	646.8	1
C5	2-氯苯基	2.17	666.7	1
C6	4-氟基苯基	2.05	657.8	1
C7	4-硝基苯基	2.05	677.9	1
C8	4-甲基苯基	2.2	646.8	1
C9	4-氟基-2-甲基苯基	2.18	664.8	1
C10	5-氯基-2-氟苯基	2.34	686.7	1
C11	2-氯基-4-硝基苯基	2.16	713.7	1
C12	呋喃-2-基	2.05	622.8	1
C13	4-三氟甲氧基苯基	2.28	716.8	1
C14	4-氟基-3-三氟甲基苯基	2.27	718.8	1
C15	4-三氟甲基苯基	2.05	700.8	1
C16	2-三氟甲氧基苯基	2.26	716.8	1
C17	2-甲氧基苯基	2.27	662.8	1
C18	苯基	2.12	634.7	1
C19	4-氟苯基	2.13	650.8	1
C20	2-三氟甲基苯基	2.17	700.7	1
C21	4-甲基-1,2,3-噁二唑-5-基	2.04	654.7	1
C22	2,3-二氟苯基	2.24	668.7	1
C23	2,4-二氟苯基	2.25	668.7	1
C24	2-氟基-5-三氟甲基苯基	2.34	718.7	1
C25	2-甲基-4-硝基苯基	2.15	690	3
C26	2,4-二氯苯基	2.22	699	3
C27	2,3-二氯苯基	2.2	699	3
C28	3-硝基苯基	2.13	676	3
C29	2-氯吡啶-3-基	2.07	666	3
C30	3,5-二甲基異噁唑-4-基	2.09	650	3
C31	2-氟基-4-氟基苯基	2.14	674	3
C32	2-甲基-3-氯苯基	2.21	679	3
C33	2,4,6-三氟苯基	2.15	685	3
C34	2-氟吡啶-3-基	2.12	650	3
C35	3-甲基-4-硝基苯基	2.17	690	3
C36	2-氟基-4-硝基苯基	2.17	694	3
C37	3-氟基-4-硝基苯基	2.14	694	3
C38	3,4-二硝基苯基	2.14	721	3
C39	3-羥基-4-硝基苯基	2.11	692	3
C40	2-氯基-4-氟基苯基	2.13	690	3
C41	3-氟基-4-氟基苯基	2.12	674	3
C42	4-氟基-3-氟基苯基	2.11	674	3
C43	2-氯基-4-甲基苯基	2.21	679	3
C44	2-氯基-3-硝基苯基	2.14	710	3

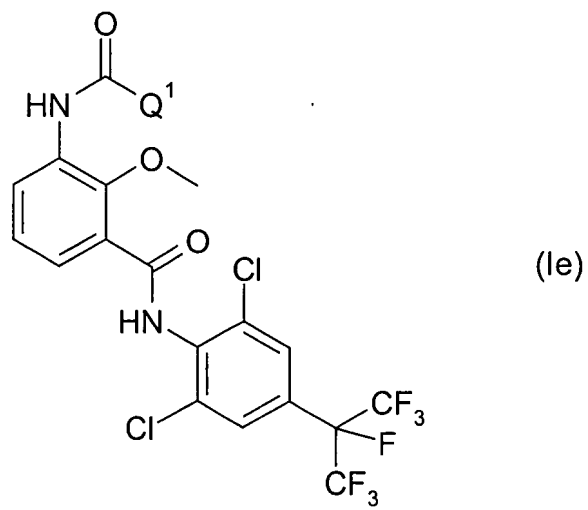
表 D：



化合物 編號	Q ¹	R ¹	RT (分鐘)	MH ⁺	LC-MS 方法
D1	苯基	Me	3.92	646.98	2
D2	苯基	Et	4.07	660.95	2
D3	4-氟基苯基	Me	3.8	671.94	2
D4	4-氟基苯基	Et	3.96	685.97	2
D5	4-氟基-2-氯苯基	Me	4.1	698.9	2
D6	4-氟基-2-氯苯基	Et	4.23	712.87	2
D7	2-氟苯基	Me	3.94	664.88	2
D8	2-甲基苯基	Me	4.02	660.96	2
D9	2-氯苯基	Me	4.05	682.92	2
D10	4-甲基苯基	Me	4.06	660.97	2
D11	4-氟基-2-甲基苯基	Me	4.04	678.96	2
D12	5-氯基-2-氟苯基	Me	4.13	698.93	2
D13	2-氯基-4-硝基苯基	Me	4.08	725.94	2
D14	呋喃-2-基	Me	3.75	636.92	2
D15	4-三氟甲氧基苯基	Me	4.26	730.94	2
D16	4-氟基-3-三氟甲基苯基	Me	4.23	732.95	2
D17	4-三氟甲基苯基	Me	4.19	714.95	2
D 18	2-三氟甲氧基苯基	Me	4.21	730.94	2
D19	2-甲氧基苯基	Me	3.9	676.97	2
D20	4-氟苯基	Me	3.95	664.96	2
D21	2-三氟甲基苯基	Me	4.15	714.95	2
D22	4-甲基-1,2,3-噁二唑-5-基	Me	3.79	668.94	2
D23	2,3-二氟苯基	Me	3.97	682.94	2
D24	2,4-二氟苯基	Me	4.01	682.96	2
D25	2-氟基-5-三氟甲基苯基	Me	4.22	732.95	2
D26	2-氟苯基	Et	4.1	678.97	2
D27	2-甲基苯基	Et	4.17	674.99	2
D28	2-氯苯基	Et	4.18	694.94	2
D29	4-甲基苯基	Et	4.2	674.99	2

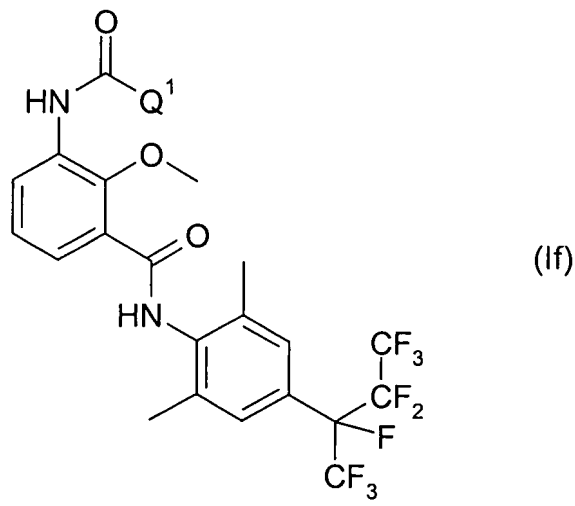
化合物 編號	Q ¹	R ¹	RT (分鐘)	MH ⁺	LC-MS 方法
D30	4-氟基-2-甲基苯基	Et	4.19	692.99	2
D31	5-氯基-2-氟苯基	Et	4.29	712.94	2
D32	2-氯基-4-硝基苯基	Et	4.22	739.84	2
D33	呋喃-2-基	Et	3.93	650.95	2
D34	4-三氟甲氧基苯基	Et	4.4	744.96	2
D35	4-氟基-3-三氟甲基苯基	Et	4.34	746.92	2
D36	4-三氟甲基苯基	Et	4.34	728.93	2
D37	2-三氟甲氧基苯基	Et	4.34	744.91	2
D38	2-甲氧基苯基	Et	4.05	690.93	2
D39	4-氟苯基	Et	4.11	678.95	2
D40	2-三氟甲基苯基	Et	4.26	728.92	2
D41	2,3-二氟苯基	Et	4.14	696.89	2
D42	2,4-二氟苯基	Et	4.14	696.89	2
D43	2-氟基-5-三氟甲基苯基	Et	4.34	746.92	2
D44	2-氯基-4-氯基苯基	Me	2.11	704	4
D45	2-氯基-4-氯基苯基	Et	2.13	718	4
D46	4-硝基苯基	Me	2.1	690	4
D47	4-硝基苯基	Et	2.15	704	4
D48	2,6-二氟苯基	Me	2.12	681	4
D49	2,6-二氟苯基	Et	2.17	696	4

表 E :



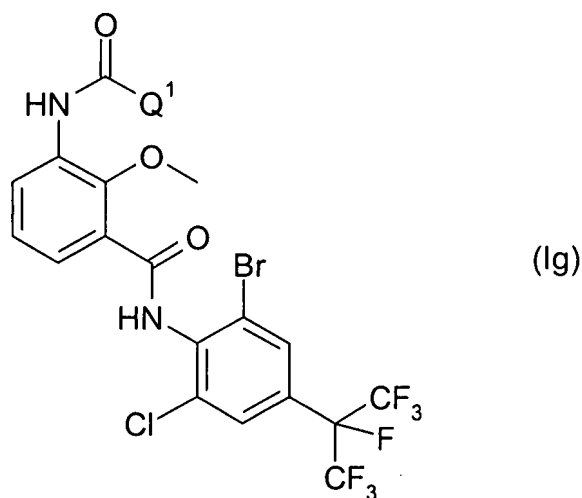
化合物 編號	Q ¹	RT (分鐘)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS 方法
E1	2-氟苯基	4.27	600.78		2
E2	2-甲基苯基	4.13	596.83		2
E3	2-氟苯基	4.11	616.78		2
E4	4-氟基苯基	3.87	607.81		2
E5	4-硝基苯基	4.06	627.82		2
E6	4-甲基苯基	4.17	596.86		2
E7	4-氟基-2-甲基苯基	4.12	614.83		2
E8	5-氟基-2-氟苯基	4.46	634.78		2
E9	2-氟基-4-硝基苯基	4.19	661.78		2
E10	呋喃-2-基	3.87	572.85		2
E11	4-三氟甲氧基苯基	4.35	666.82		2
E12	4-氟基-3-三氟甲基苯基	4.31	668.82		2
E13	4-三氟甲基苯基	4.3	650.85		2
E14	2-三氟甲氧基苯基	4.3	666.87		2
E15	2-甲氧基苯基	4.29	612.87		2
E16	苯基	4	582.87		2
E17	4-氟苯基	4.04	600.85		2
E18	2-三氟甲基苯基	4.13	650.88		2
E19	2-氟基-4-氟苯基	4.16	634.82		2
E20	4-甲基-1,2,3-噁二唑-5-基	3.81	604.82		2
E21	2,3-二氟苯基	4.24	618.85		2
E22	2,4-二氟苯基	4.31	618.85		2
E23	2-氟基-5-三氟甲基苯基	4.48	668.86		2
E24	2,5-二氟基-4-氟基苯基			192	
E25	2-甲基-4-氟基苯基	2.08	620		4
E26	3-甲基-4-硝基苯基	2.13	640		4
E27	2-甲基-4-硝基苯基	2.11	640		4
E28	2,4,6-三氟苯基	2.11	635		4
E29	2,6-二氟苯基	2.09	617		4

表 F：



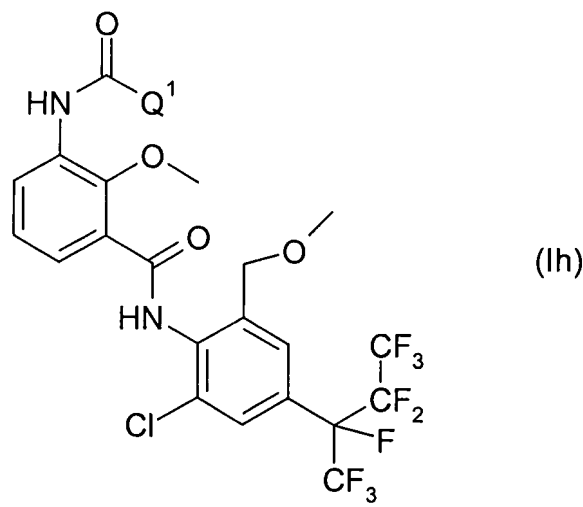
化合物 編號	Q ¹	RT (分鐘)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS 方法
F1	2-氟苯基	4.2	610.92		2
F2	2-甲基苯基	4.05	606.96		2
F3	2-氯苯基	4.07	626.9		2
F4	呋喃-2-基	3.85	582.98		2
F5	4-三氟甲氧基苯基	4.3	676.94		2
F6	3-三氟甲基-4-氟苯基	4.28	678.96		2
F7	4-甲基-1,2,3-噁二唑-5-基	3.8	614.95		2
F8	2,3-二氟苯基	4.2	628.96		2
F9	2,4-二氟苯基	4.23	628.97		2
F10	2,4,6-三甲基苯基	4.29	635.03		2
F11	2,3-二甲基苯基	4.17	621.05		2
F12	2-氟基-5-氯苯基	4.42	644.97		2
F13	2-氟基-4-氯苯基	4.42	644.97		2
F14	2-氟基-4-三氟甲基苯基	4.43	679		2
F15	2,4-二氯苯基	4.29	660.95		2
F16	2-氯基-4-甲磺基苯基	3.78	704.95		2
F17	3,4-二氯苯基	4.38	660.91		2
F18	4-甲磺基苯基	3.64	670.96		2
F19	4-氯苯基	4.19	626.97		2
F20	3-氟苯基	4.05	611		2
F21	3-氯基苯基	3.9	618		2
F22	3-甲氧基苯基	4.03	623		2
F23	3-甲基-4-硝基苯基			179	
F24	2-甲基-4-硝基苯基			203	
F25	2,4,6-三氟苯基			194	
F26	4-三氟甲基苯基			163	
F27	2-甲基-4-氟苯基			178	
F28	2-氯基-4-硝基苯基			207	
F29	4-硝基苯基			105	
F30	2-氯基-4-氟苯基			164	

表 G：



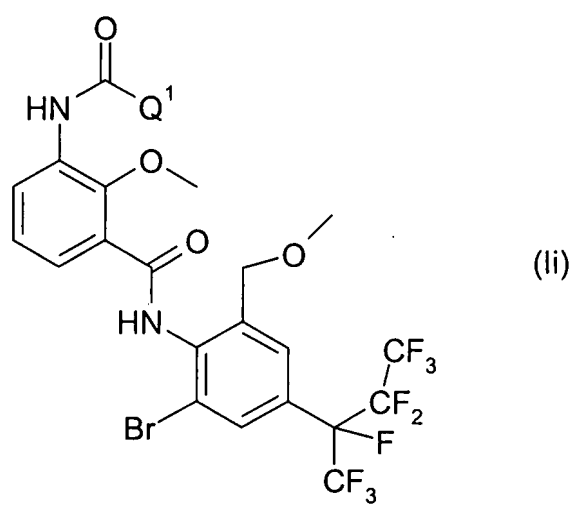
化合物 編號	Q ^I	RT (分鐘)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS 方法
G1	2-甲基-4-氰基苯基			190	
G2	2-氯基-4-氰基苯基			211	
G3	2,4,6-三氟苯基			181	
G4	2,6-二氟基-4-氰基苯基			118	
G5	2-氯基-4-氟苯基	4.23	679.1	183	2
G6	2-氟苯基	4.3	645.15		2
G7	2-甲基苯基	4.15	641.19		2
G8	2-氯苯基	4.17	661.13		2
G9	4-氟基苯基	3.93	652.17		2
G10	4-硝基苯基	4.08	672.14		2
G11	4-甲基苯基	4.23	641.19		2
G12	4-氟基-2-甲基苯基	4.19	659.17		2
G13	5-氯基-2-氟苯基	4.52	679.12		2
G14	2-氯基-4-硝基苯基	4.2	706.1		2
G15	呋喃-2-基	3.94	617.14		2
G16	4-三氟甲氧基苯基	4.41	711.11		2
G17	4-氟基-3-三氟甲基苯基	4.4	713.12		2
G18	4-三氟甲基苯基	4.36	695.12		2
G19	2-三氟甲氧基苯基	4.37	711.11		2
G20	2-甲氧基苯基	4.43	657.17		2
G21	苯基	4.07	627.15		2
G22	4-氟苯基	4.09	645.15		2
G23	2-三氟甲基苯基	4.18	695.12		2
G24	4-甲基-1,2,3-噁二唑-5-基	3.88	649.12		2
G25	2,3-二氟苯基	4.3	663.15		2
G26	2,4-二氟苯基	4.34	663.15		2
G27	2-氟基-5-三氟甲基苯基	4.54	713.12		2

表 H：



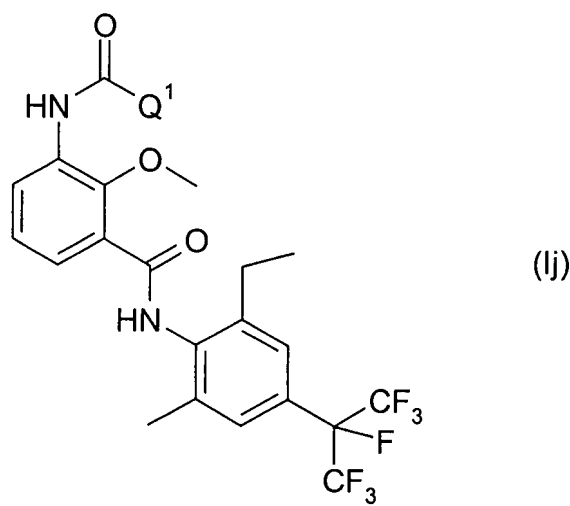
化合物 編號	Q ¹	RT (分鐘)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS 方法
H1	2-甲基-4-氟基苯基			110	
H2	2,4,6-三氟苯基			138	
H3	2-氟苯基	4.44	661.33		2
H4	2-甲基苯基	4.32	657.37		2
H5	2-氯苯基	4.33	677.32		2
H6	4-氟基苯基	4.12	668.35		2
H7	4-硝基苯基	4.22	688.35		2
H8	4-甲基苯基	4.38	657.24		2
H9	4-氟基-2-甲基苯基	4.35	675.36		2
H10	5-氯基-2-氟苯基	4.68	695.29		2
H11	2-氯基-4-硝基苯基	4.34	722.28		2
H12	呋喃-2-基	4.13	633.33		2
H13	4-三氟甲氧基苯基	4.55	727.29		2
H14	4-氟基-3-三氟甲基苯基	4.51	729.3		2
H15	4-三氟甲基苯基	4.5	711.3		2
H16	2-三氟甲氧基苯基	4.53	727.32		2
H17	2-甲氧基苯基	4.52	673.35		2
H18	苯基	4.2	643.27		2
H19	4-氟苯基	4.24	661.27		2
H20	2-三氟甲基苯基	4.34	711.3		2
H21	4-甲基-1,2,3-噁二唑-5-基	4.04	665.3		2
H22	2,3-二氟苯基	4.48	679.32		2
H23	2,4-二氟苯基	4.48	679.29		2
H24	2-氟基-5-三氟甲基苯基	4.66	729.3		2
H25	2-氯基-4-氟苯基	4.39	695.26	98	2

表 I：



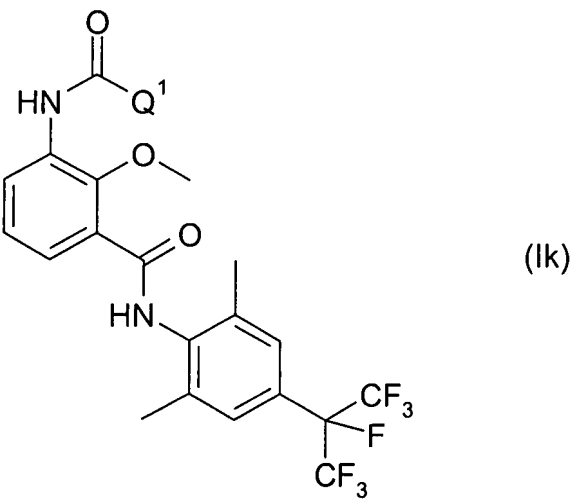
化合物 編號	Q ¹	RT (分鐘)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS 方法
I1	2-甲基-4-氟基苯基			130	-
I2	2,4,6-三氟苯基			190	-
I3	2-氟苯基	4.47	705.3		2
I4	2-甲基苯基	4.3	701.3		2
I5	2-氯苯基	4.33	721.2		2
I6	4-氟基苯基	4.18	712.3		2
I7	4-硝基苯基	4.22	732.3		2
I8	4-甲基苯基	4.39	701.29		2
I9	4-氟基-2-甲基苯基	4.39	719.29		2
I10	5-氯基-2-氟苯基	4.66	739.24		2
I11	2-氯基-4-硝基苯基	4.5	766.26		2
I12	呋喃-2-基	4.12	677.26		2
I13	4-三氟甲氧基苯基	4.55	771.28		2
I14	4-氟基-3-三氟甲基苯基	4.51	773.29		2
I15	4-三氟甲基苯基	4.5	755.29		2
I16	2-三氟甲氧基苯基	4.54	771.28		2
I17	2-甲氧基苯基	4.52	717.34		2
I18	苯基	4.23	687.32		2
I19	4-氟苯基	4.24	705.32		2
I20	2-三氟甲基苯基	4.34	755.29		2
I21	4-甲基-1,2,3-噁二唑-5-基	4.05	709.29		2
I22	2,3-二氟苯基	4.45	723.27		2
I23	2,4-二氟苯基	4.5	723.31		2
I24	2-氟基-5-三氟甲基苯基	4.68	773.29		2
I25	2-氯基-4-氟苯基	4.4	739.26	113	2

表 J：



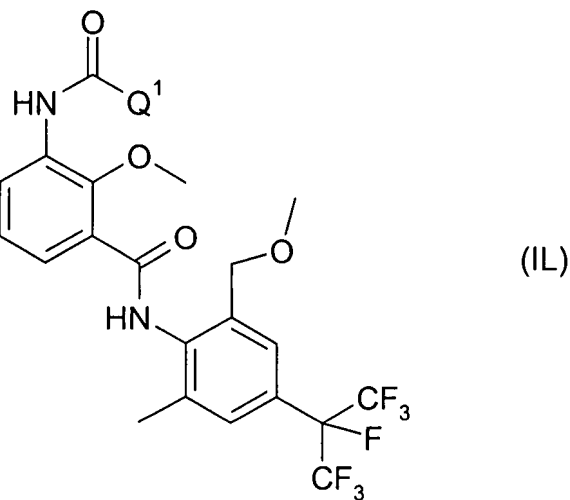
化合物 編號	Q ¹	RT (分鐘)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS 方法
J1	2-氯基-4-氟基苯基			110	
J2	2,6-二氟基-4-氟基苯基			113	
J3	2,4,6-三氟基苯基			96	
J4	2-甲基-4-氟基苯基			102	
J5	2-氟基苯基	4.34	575.36		2
J6	2-甲基苯基	4.16	571.33		2
J7	2-氯基苯基	4.15	591.35		2
J8	4-氟基苯基	3.99	582.38		2
J9	4-硝基苯基	4.07	602.36		2
J10	4-甲基苯基	4.22	571.4		2
J11	4-氟基-2-甲基苯基	4.19	589.4		2
J12	5-氯基-2-氟基苯基	4.52	609.32		2
J13	2-氯基-4-硝基苯基	4.23	636.31		2
J14	呋喃-2-基	3.95	547.36		2
J15	4-三氟甲氧基苯基	4.41	641.32		2
J16	4-氟基-3-三氟甲基苯基	4.4	643.33		2
J17	4-三氟甲基苯基	4.37	625.33		2
J18	2-三氟甲氧基苯基	4.38	641.32		2
J19	2-甲氧基苯基	4.37	587.38		2
J20	苯基	4.08	557.36		2
J21	4-氟基苯基	4.08	575.36		2
J22	2-三氟甲基苯基	4.19	625.33		2
J23	4-甲基-1,2,3-噁二唑-5-基	3.87	579.33		2
J24	2,3-二氟基苯基	4.33	593.36		2
J25	2,4-二氟基苯基	4.34	593.36		2
J26	2-氟基-5-三氟甲基苯基	4.54	643.33		2
J27	2-氯基-4-氟基苯基	4.23	609.29	88	2

表 K：



化合物 編號	Q¹	MP (°C)
K1	2,4,6-三氟苯基	173
K2	4-硝基苯基	190
K3	2-氯基-4-氟基苯基	133
K4	2-甲基-4-氟基苯基	152

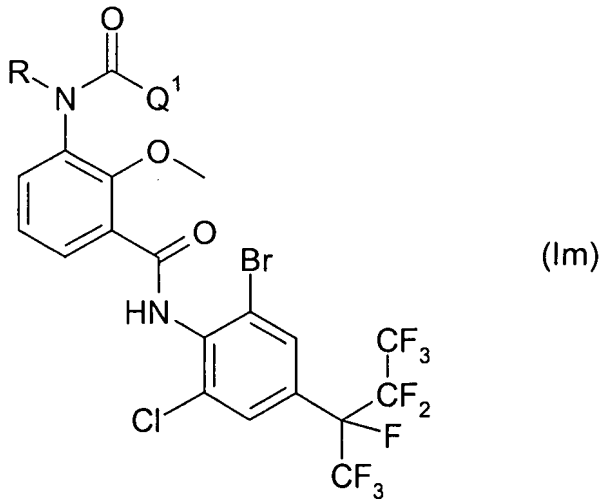
表 L：



化合物 編號	Q¹	RT (分鐘)	MH⁺	LC-MS 方法
L1	2-氟苯基	4.34	639.5	2
L2	2-甲基苯基	4.2	635.53	2
L3	2-氯苯基	4.21	655.45	2

L4	4-氟基苯基	4.01	646.52	2
L5	4-硝基苯基	4.11	666.48	2
L6	4-甲基苯基	4.26	635.52	2
L7	4-氟基-2-甲基苯基	4.23	653.23	2
L8	5-氟基-2-氟苯基	4.53	673.43	2
L9	2-氟基-4-硝基苯基	4.22	700.45	2
L10	呋喃-2-基	3.98	611.52	2
L11	4-三氟甲氧基苯基	4.43	705.51	2
L12	4-氟基-3-三氟甲基苯基	4.4	707.51	2
L13	4-三氟甲基苯基	4.38	689.52	2
L14	2-三氟甲氧基苯基	4.4	705.29	2
L15	2-甲氧基苯基	4.41	651.52	2
L16	苯基	4.1	621.4	2
L17	4-氟苯基	4.13	639.5	2
L18	2-三氟甲基苯基	4.22	689.51	2
L19	2-氟基-4-氟苯基	4.25	673.48	2
L20	4-甲基-1,2,3-噁二唑-5-基	3.93	643.46	2
L21	2,3-二氟苯基	4.33	657.02	2
L22	2,4-二氟苯基	4.36	657.51	2
L23	2-氟基-5-三氟甲基苯基	4.55	707.51	2

表 M：



化合物 編號	Q ¹	R	RT (分鐘)	MH ⁺	LC-MS 方法
M1	2-甲基-4-氟基苯基	Et	2.14	742	4
M2	3-甲基-4-硝基苯基	Et	2.17	762	4

生物例

這些實施例舉例說明式(I)化合物的殺蟲和殺蟎性質。
如下完成測試：

海灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis*) (埃及棉葉蟲)

將棉花葉圓盤放置在 24-孔微量滴定盤中的瓊脂上且以 200 ppm 的施用率噴灑測試溶液。乾燥之後，該等葉圓盤以 5 隻 L1 幼蟲感染。處理後 3 天(DAT)檢查該等樣品之死亡率、進食行為和生長調節。

下列化合物產生海灰翅夜蛾的至少 80% 控制：A1 至 A22、B202 至 B207、B188、B187、B186、B185、B159、B158、B152、B151、B150、B166、B148、B147、B146、B144、B142、B141、B139、B138、B137、B135、B134、B131、B130、B128、B127、B126、B124、B120、B117、B116、B115、B114、B113、B112、B111、B110、B109、B105、B104、B102、B101、B100、B99、B98、B97、B96、B95、B94、B93、B92、B89、B88、B87、B86、B85、B84、B82、B81、B83、B80、B77、B74、B73、B72、B71、B70、B69、B68、B67、B66、B65、B64、B62、B61、B58、B56、B55、B54、B52、B48、B45、B44、B42、B39、B37、B36、B32、B31、B30、B28、B27、B26、B25、B175、B174、B176、B170、B169、B168、B167、B154、B172、B153、B180、B179、B178、B182、B184、B183、B156、B195、B194、B193、B155、B192、B191、B190、B189、B157、B198、B197、B196、B24、B23、B22、B21、B20、B19、B18、B17、B16、B15、B14、B13、B12、B11、B10、B9、B8、B7、B6、

B5、B4、B3、B2、B1、C1 至 C15、C18 至 C23、C25 至 C36、D1 至 D13、D15、D17、D20、D23、D22、D26 至 D30、D32 至 D36、D39 至 D42、D44 至 D49、E1 至 E22、E24、E25 至 E29、F1 至 F9、F12、F13、F15 至 F30、G1 至 G5、K1 至 K4、M1、M2。

菸草青蟲(*Heliothis virescens*)(煙夜蛾(tobacco budworm))：

將蛋(0-24 小時大)放置在 24-孔微量滴定盤中的人工飲食上和藉由吸量以 200 ppm(在孔中的濃度 18 ppm)的施用率用測試溶液處理。在 4 天的培育期之後，檢查樣品之蛋死亡率、幼蟲死亡率和生長調節。

下列化合物產生菸草青蟲的至少 80% 控制：A1、A4、A6 至 A21、B202 至 B207、B188、B185、B163、B162、B161、B159、B158、B152、B151、B150、B166、B148、B146、B144、B141、B139、B138、B137、B135、B134、B131、B130、B128、B127、B126、B125、B124、B120、B117、B116、B115、B114、B113、B112、B111、B110、B109、B104、B102、B101、B100、B99、B98、B97、B96、B95、B94、B93、B89、B88、B87、B86、B85、B84、B82、B81、B83、B80、B77、B74、B73、B72、B70、B69、B68、B67、B66、B65、B64、B62、B61、B58、B56、B55、B52、B48、B45、B44、B42、B39、B36、B32、B31、B30、B27、B26、B25、B175、B174、B176、B171、B170、B169、B168、B167、B172、B153、B180、B179、B178、B182、B184、B183、B156、B195、B194、B193、B155、B192、B191、B190、B189、B157、B198、B197、B23、B22、B21、B20、B19、

B18、B17、B15、B13、B12、B11、B10、B9、B8、B7、B6、B5、B4、B3、B2、B1、C1 至 C23、C25 至 C29、C31 至 C35、D1 至 D7、D10 至 D13、D15、D16、D20、D22 至 D24、D26、D28 至 D30、D32、D35、D36、D39 至 D42、D44 至 D49、E1 至 E24、E25 至 E29、F1 至 F9、F12、F13、F15 至 F30、G1 至 G5、H1、H2、H25、I1、I2、I25、J2 至 J4、J27、K1 至 K4、M1、M2。

小菜蛾 (*Plutella xylostella*)(吊絲蟲 (diamond back moth))：

具有人工飲食的 24-孔微量滴定盤(MTP)藉由吸量以 200 ppm (在孔中之濃度 18 ppm)的施用率用測試溶液處理。乾燥之後，以 L2 幼蟲(每孔 7-12 隻)感染 MTP。在 6 天的培育期之後，檢查樣品之幼蟲死亡率和生長調節。

下列化合物產生小菜蛾的至少 80% 控制：A1、A2、A4 至 A22、B202 至 B207、B187、B185、B164、B163、B162、B161、B160、B159、B158、B152、B151、B150、B166、B148、B146、B144、B141、B139、B138、B137、B135、B134、B131、B130、B128、B127、B126、B125、B124、B120、B117、B116、B115、B114、B113、B112、B111、B110、B109、B105、B104、B102、B101、B100、B99、B98、B97、B96、B95、B94、B93、B89、B88、B87、B86、B85、B84、B82、B81、B83、B80、B77、B74、B73、B72、B71、B69、B67、B66、B65、B64、B62、B61、B58、B57、B56、B55、B54、B52、B48、B45、B44、B42、B39、B37、B36、B32、B31、B28、B27、B26、B25、B175、B174、B176、

B171、B170、B169、B168、B154、B172、B153、B180、
 B179、B178、B182、B184、B183、B156、B195、B194、
 B193、B155、B192、B191、B190、B189、B198、B197、
 B196、B23、B22、B21、B20、B19、B18、B16、B15、B14、
 B13、B12、B11、B10、B9、B8、B7、B6、B5、B4、B3、
 B2、B1、C1 至 C9、C11 至 C13、C15、C18 至 C23、C25
 至 C29、C31 至 C35、D1 至 D13、D15、D16、D20、D22
 至 D24、D26 至 D30、D32、D36、D39 至 D42、D44 至 D49、
 E4 至 E22、E24、E25 至 E29、F1 至 F9、F11、F15 至 F27、
 F29、F30、G1 至 G5、H1、H2、H25、I1、I2、I25、J1 至 J4、
 J27、K1 至 K4、M1、M2。

黃瓜條葉甲 (*Diabrotica balteata*)(玉米根蟲)：

具有人工飲食的 24-孔微量滴定盤(MTP)藉由吸量以
 200 ppm(在孔中之濃度為 18 ppm)的施用率用測試溶液處
 理。乾燥之後，以 L2 幼蟲(每孔 6-10 隻)感染 MTP。在 5
 天的培育期之後，檢查樣品之幼蟲死亡率和生長調節。

下列化合物產生黃瓜條葉甲的至少 80% 控制：A1、A3
 至 A13、A15 至 A20、A22、B202 至 B206、B187、B185、
 B163、B162、B161、B159、B158、B151、B150、B166、
 B146、B144、B137、B135、B134、B131、B130、B128、
 B127、B126、B125、B120、B117、B116、B115、B113、
 B112、B111、B110、B109、B101、B100、B98、B97、B96、
 B93、B92、B89、B87、B86、B85、B84、B82、B81、B83、
 B80、B74、B73、B72、B69、B67、B66、B64、B62、B61、
 B58、B56、B55、B54、B52、B45、B44、B42、B37、B36、

B32、B30、B28、B27、B26、B25、B174、B170、B169、
 B168、B167、B154、B153、B180、B179、B178、B181、
 B184、B183、B156、B194、B155、B192、B22、B21、B20、
 B18、B9、B5、B4、B3、C1 至 C13、D15、C19 至 C23、
 C25 至 C29、C31 至 C36、D1 至 D13、D15 至 D17、D20 至
 D23、D26 至 D30、D32、D36、D39、D42、D41、D44 至
 D49、E1 至 E7、E8、E9、E11、E13、E16 至 E22、E24、
 E25 至 E29、F1、F3、F7 至 F9、F12、F15 至 F23、F24
 至 F30、G1 至 G5、H2、H25、I1、I2、I25、J1 至 J4、J27、
 K1 至 K4、M2。

蔥薊馬(*Thrips tabaci*)(洋蔥薊馬(Onion thrips))

將向日葵葉圓盤放置於 24 孔微量滴定盤中的瓊脂上及
 以 200ppm 的施用率噴灑測試溶液。在乾燥之後，將葉片圓
 盤以混齡的蚜蟲族群感染。在 7 天的培育期之後，檢視樣
 品的死亡率。

下列化合物產生蔥薊馬之至少 80% 控制：A2 至 A13、
 A17 至 A20、A22、B202、B204、B163、B162、B161、B151、
 B150、B146、B137、B135、B134、B127、B124、B115、
 B113、B112、B111、B110、B109、B101、B97、B93、B92、
 B89、B87、B82、B81、B80、B74、B73、B67、B66、B65、
 B64、B58、B55、B54、B52、B49、B46、B45、B44、B42、
 B37、B36、B28、B27、B26、B25、B175、B174、B176、
 B169、B168、B167、B154、B172、B153、B180、B178、
 B184、B183、B156、B155、B192、B191、B190、B21、B20、
 B9、B4、B1、C1 至 C9、C11、C13、C15、C18、C19、C20

至 C23、C25、C26、C29、C31、C33、D1 至 D5、D9、D12、D15、D17、D20、D22、D23、D26 至 D30、D32 至 D36、D44 至 D49、E1 至 E7、E9、E11、E12、E13、E16 至 E22、E25、E27 至 E29、F3、F7、F8、F20、F21、F29、F30、H25、I2、I25、J27、K1、K2、M1。

二點葉蟎 (*Tetranychus urticae*) (二斑葉蟎 (two-spotted spider mite))

在 24 孔微量滴定盤中的瓊脂上之豆葉圓盤以 200ppm 的施用率噴灑測試溶液。在乾燥之後，將葉片圓盤以混齡的蟎族群感染。在 8 天之後，檢視圓盤卵的死亡率、幼蟲死亡率和成蟲死亡率。

下列化合物產生二點葉蟎之至少 80% 控制：A2 至 A7、A10、A11、A16 至 A18、A22、B202、B204、B159、B158、B151、B150、B139、B138、B135、B134、B128、B127、B113、B111、B110、B109、B106、B104、B101、B98、B97、B96、B93、B82、B81、B80、B74、B73、B69、B67、B66、B65、B64、B61、B55、B54、B42、B36、B28、B26、B174、B176、B171、B170、B169、B168、B154、B172、B153、B180、B179、B178、B184、B183、B156、B195、B194、B193、B155、B192、B191、B190、B189、B198、B197、B196、B23、B21、B19、B15、B13、B11、B9、B8、B7、B6、B5、B4、B2、B1、C2、C4 至 C9、C11、C12、C13、C15、C19 至 C23、C25、C26、C29、C33、D2 至 D6、D8、D11、D13、D20、D22、D32、D39、D44 至 D49、E4、E5、E7、E9、E12、E13、E17、E19、E20、E24、E25、E27 至

E29、F21、F18、F15、F7、F5、F1、F28、F27、F25、F24、F29、F30、G1 至 G5、J2、J27、K1 至 K4、M1。

桃蚜 (*Myzus persicae*) (綠桃蚜蟲 (green peach aphid))

將向日葵葉圓盤放置於 24 孔微量滴定盤中的瓊脂上及以 200ppm 的施用率噴灑測試溶液。在乾燥之後，將葉片圓盤以混齡的蚜蟲族群感染。在培育期 6DAT 之後，檢視樣品的死亡率。

下列化合物產生桃蚜之至少 80% 控制：A3、A4、A10、A11、A13、A17、A18、A22、B204、B151、B150、B137、B124、B111、B106、B98、B93、B89、B82、B80、B66、B55、B54、B45、B44、B42、B37、B36、B28、B26、B174、B168、B153、B156、B155、B189、B19、B18、B15、B8、B7、B6、B5、B4、B2、C1、C4 至 C6、C8、C18、C19、D1 至 D4、D20、D21、D39、D45、D48、D49、E1、E2、E4 至 E6、E9、E11、E12、E13、E16、E17、E21、E25、E27 至 E29、F7、F30、G3、G4、G5、H1、H25、I2、I25、J27、K2、K27。

【圖式簡單說明】

無

【主要元件符號說明】

無

發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※ 申請案號： 99114183

A01N 37/18 (2006.01)

※ 申請日： 99.5.6

※IPC 分類：

C07C 237/44 (2006.01)

C07C 255/57 (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

A01P 5/00 (2006.01)

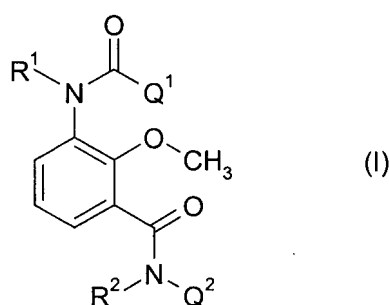
A01P 7/00 (2006.01)

殺蟲化合物 / INSECTICIDAL COMPOUNDS

A01P 9/00 (2006.01)

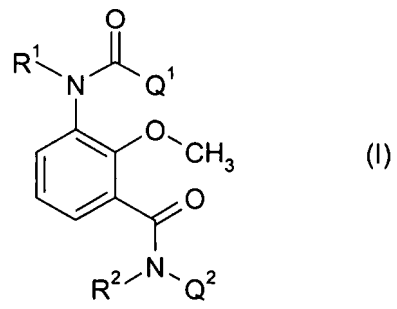
二、中文發明摘要：

本發明係關於式(I)之雙-醯胺衍生物、用於製備該等衍生物之方法和中間產物、使用該等衍生物以控制昆蟲、蟎、線蟲和軟體動物有害生物之方法及包含該等衍生物的殺蟲、殺蟎、殺線蟲和殺軟體動物之組成物



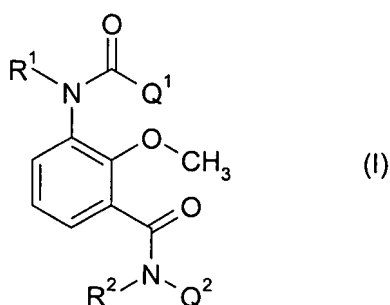
三、英文發明摘要：

The present invention relates to bis-amide derivatives of formula (I), to processes and intermediates for preparing them, to methods of using them to control insect, acarine, nematode and mollusc pests, and to insecticidal, acaricidal, nematocidal and molluscicidal compositions comprising them



七、申請專利範圍：

1. 一種式(I)之化合物，



其中

Q^1 為芳基或雜環基，各自視需要地經一至五個 R^3 取代基取代，該 R^3 取代基可為相同或不同；

Q^2 係選自

2-乙基-6-甲基-4-(九氟丁-2-基)苯基、

2-溴基-6-氯基-4-(九氟丁-2-基)苯基、

2,6-二氯基-4-(九氟基-丁-2-基)苯基、

2,6-二甲基-4-(九氟基-丁-2-基)苯基、

2-氯基-6-甲氧基甲基-4-(九氟丁-2-基)苯基、及

2-溴基-6-甲氧基甲基-4-(九氟丁-2-基)苯基；

R^1 係選自氫、 C_1 - C_8 烷基、 C_1 - C_8 烷羰基、 C_1 - C_8 烷氧羰基和 C_1 - C_4 烷基- $C(O)NH_2$ ；

R^2 係選自氫、 C_1 - C_8 烷基、 C_1 - C_8 烷羰基、 C_1 - C_8 烷氧羰基和 C_1 - C_4 烷基- $C(O)NH_2$ ；及

R^3 係選自氰基、硝基、鹵素、羥基、乙醯氧基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷氧基、 CN - C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷基- $C(O)O$ 、 C_1 - C_4 烷基- $S(O)_2$ 、 NH_2 、

C₁-C₄ 烷基 NH、(C₁-C₄ 烷基)₂N、(C₁-C₄ 烷基 O)₂P(O)O、苯基和包含 1 至 3 個獨立地選自氮、氧和硫之雜原子的五至六員單環雜環；

或其農業化學上可接受的鹽或 N-氧化物。

2.根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 Q¹ 係選自苯基、聯苯基和包含 1、2 或 3 個獨立地選自氮、氧和硫之雜原子的五至六員單環雜芳基基團；各自視需要地經一至五個取代基 R³ 取代，該 R³ 取代基可為相同或不同。

3.根據申請專利範圍第 2 項之化合物，其中 Q¹ 係選自苯基、聯苯基、呋喃基、吡啶基、噻吩基、噻二唑基、𪗇唑基、異𪗇唑基、噻唑基、異噻唑基、吡唑基和嘧啶基；各自視需要經一至三個 R³ 取代基取代，該 R³ 取代基可為相同或不同。

4.根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 R³ 係選自氰基、硝基、氟基、氯基、溴基、碘基、羥基、乙醯氧基、甲基、乙基、異丙基、第三丁基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、甲硫基、異丙硫基、3-乙氧基-正丙基、甲氧基甲基、2-甲氧基乙氧基、CH₂CN、C(O)OCH₃、S(O)₂CH₃、NH₂、N(CH₃)₂、OP(O)(CH₂CH₃)₂、苯基、N-吡咯甲醯基(pyrrolyl)、噻二唑基和吡啶基。

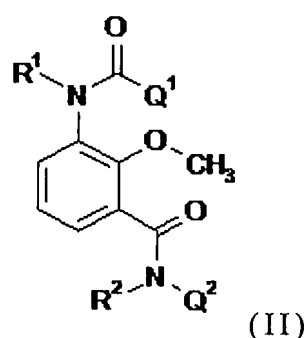
5.根據申請專利範圍第 4 項之化合物，其中 R³ 係選自氰基、硝基、溴基、氯基、氟基、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基和三氟甲氧基。

6.根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 R¹ 和 R² 皆

為氫。

7. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 Q^2 係選自 2-乙基-6-甲基-4-(九氟基-丁-2-基)苯基、2-溴基-6-氯基-4-(九氟基-丁-2-基)苯基、及 2,6-二氯基-4-(九氟基-丁-2-基)苯基。

8. 一種式 (II) 之化合物，



其中

Q^1 如申請專利範圍第 1 至 3 項中任一項中所定義；

R^1 和 R^2 如申請專利範圍第 1 項或申請專利範圍第 6 項中所定義；

R^3 如申請專利範圍第 1、4 或 5 項中任一項中所定義；及

Q^2 係選自：

2-乙基-6-甲基-4-(全氟異丙基)苯基、

2-溴基-6-氯基-4-(全氟異丙基)苯基、

2,6-二氯基-4-(全氟異丙基)苯基、

2,6-二甲基-4-(全氟異丙基)苯基、及

2-甲基-6-甲氧基甲基-4-(全氟異丙基)苯基；

或其農業化學上可接受的鹽或 N-氧化物。

9. 一種控制昆蟲、蟎、線蟲或軟體動物之方法，其包含將殺蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物有效量的如申請專利

範圍第 1 至 8 項中任一項中所定義的式(I)化合物投與至有害生物、有害生物的所在地或容易被有害生物攻擊的植物。

10.一種殺蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物之組成物，其包含殺蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物有效量的如申請專利範圍第 1 至 8 項中任一項中所定義之式(I)化合物，與農業化學上可接受之稀釋劑或載劑。

11.根據申請專利範圍第 10 項之組合物，其進一步包含一或多種另外的殺蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物之化合物。

八、圖式：

無

範圍第 1 至 8 項中任一項中所定義的式(I)化合物投與至有害生物、有害生物的所在地或容易被有害生物攻擊的植物。

10.一種殺蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物之組成物，其包含殺蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物有效量的如申請專利範圍第 1 至 8 項中任一項中所定義之式(I)化合物，與農業化學上可接受之稀釋劑或載劑。

11.根據申請專利範圍第 10 項之組合物，其進一步包含一或多種另外的殺蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物之化合物。

八、圖式：

無

四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第（ 無 ）圖。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

無

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

