



(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 201738248 A

(43)公開日：中華民國 106 (2017) 年 11 月 01 日

(21)申請案號：106101784

(22)申請日：中華民國 106 (2017) 年 01 月 19 日

(51)Int. Cl.:

C07D519/00 (2006.01)

A01N43/90 (2006.01)

(30)優先權：2016/01/22

歐洲專利局

16152384.0

(71)申請人：拜耳作物科學股份有限公司 (德國) BAYER CROPSCIENCE

AKTIENGESELLSCHAFT (DE)

德國

(72)發明人：菲舍爾 盧迪格 FISCHER, RUEDIGER (DE)；霍夫邁斯特 蘿拉 HOFFMEISTER, LAURA (DE)；維爾克 大衛 WILCKE, DAVID (DE)；考施 布塞斯 妮娜 KAUSCH-BUSIES, NINA (DE)；哈格 杜米尼克 HAGER, DOMINIK (DE)；維約 馬修 WILLOT, MATTHIEU (FR)；伊爾奇 克爾斯汀 ILG, KERSTIN (DE)；艾爾穆斯 薩沙 EILMUS, SASCHA (DE)；格根斯 烏利奇 GOERGENSE, ULRICH (DE)；藤柏格 安德烈 TURBERG, ANDREAS (DE)

(74)代理人：陳彥希；何愛文

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：20 項 圖式數：0 共 164 頁

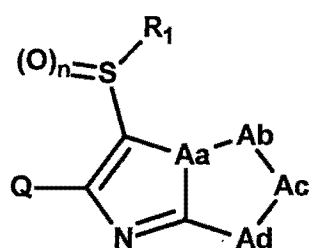
(54)名稱

作為除害劑之稠合雙環雜環衍生物

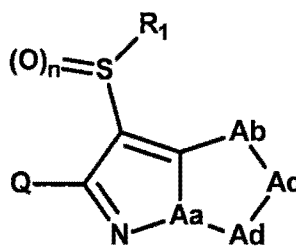
FUSED BICYCLIC HETEROCYCLE DERIVATIVES AS PESTICIDES

(57)摘要

本發明係關於新穎的式(I)或(I')化合物



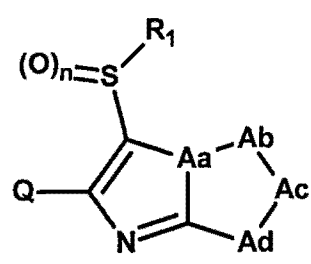
(I)



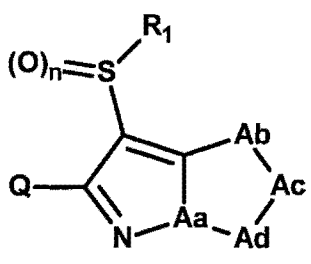
(I')

其中 R^1 、Aa、Ab、Ac、Ad、Q 和 n 具有上述所給予之定義，其作為殺蟎劑及/或殺昆蟲劑供防治動物害蟲之用途，以及用於其製備之方法和中間物。

The invention relates to novel compounds of the formula (I) or (I')

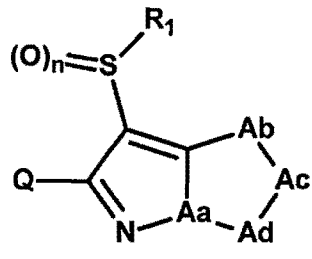
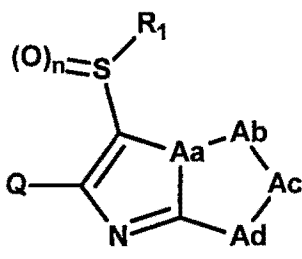


(I)



(I')

in which R^1 , Aa, Ab, Ac, Ad, Q and n have the definitions given above, to the use thereof as acaricides and/or insecticides for controlling animal pests and to processes and intermediates for the preparation thereof.
特徵化學式：



(I)(I')

發明摘要

※ 申請案號： 106101784

※ 申請日： 106/01/19

※ I P C 分類： **C07D 519/00** (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01)

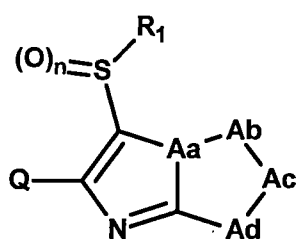
【發明名稱】 (中文/英文)

作為除害劑之稠合雙環雜環衍生物

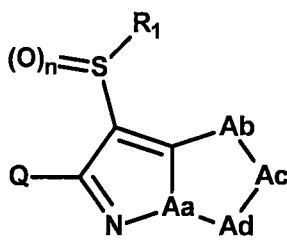
FUSED BICYCLIC HETEROCYCLE DERIVATIVES AS PESTICIDES

【中文】

本發明係關於新穎的式(I)或(I')化合物



(I)



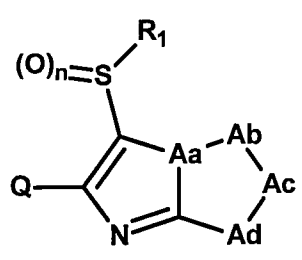
(I')

其中 R^1 、Aa、Ab、Ac、Ad、Q 和 n 具有上述所給予之定義，

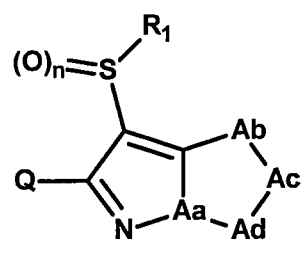
其作為殺蟎劑及/或殺昆蟲劑供防治動物害蟲之用途，以及用於其製備之方法和中間物。

【英文】

The invention relates to novel compounds of the formula (I) or (I')



(I)



(I')

in which R^1 , Aa, Ab, Ac, Ad, Q and n have the definitions given above,
to the use thereof as acaricides and/or insecticides for controlling animal pests
and to processes and intermediates for the preparation thereof.

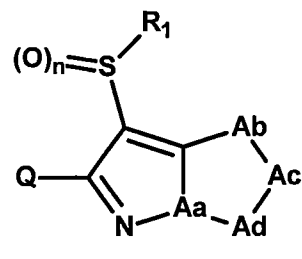
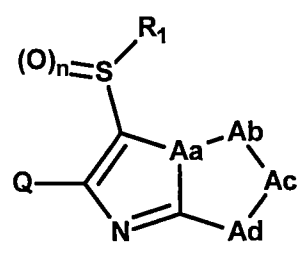
【代表圖】

【本案指定代表圖】：第（ 無 ）圖。

【本代表圖之符號簡單說明】：

無

【本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式】：



(I)(I')

發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動)

【發明名稱】(中文/英文)

作為除害劑之稠合雙環雜環衍生物

FUSED BICYCLIC HETEROCYCLE DERIVATIVES AS PESTICIDES

【技術領域】

本發明係關於新穎的式(I)或式(I')之稠合雙環雜環衍生物，其作為殺蟎劑及/或殺昆蟲劑供防治動物性害蟲，特別是節肢動物及特別是昆蟲和蜘蛛類之用途，以及用於其製備之方法和中間物。

【先前技術】

具有殺昆蟲屬性之稠合雙環雜環衍生物在文獻中已有描述，例如在 WO 2010/125985、WO 2012/074135、WO 2012/086848、WO 2013/018928、WO 2013/191113、WO 2014/142292、WO 2014/148451、WO 2015/000715、WO 2016/124563、WO 2016/124557、EP 15191440.5、WO 2015/121136、WO 2016/129684、PCT/EP2016/057389、EP 15197267.6、EP 16168252.1、EP 16184163.0、EP16189445.6 中。

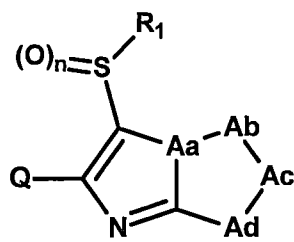
然而，已知來自上述所引述之文件的一些活性成份在使用上有其缺點，無論是在其僅具有窄譜的應用或是不具有令人滿意的殺昆蟲或殺蟎活性上。

【發明內容】

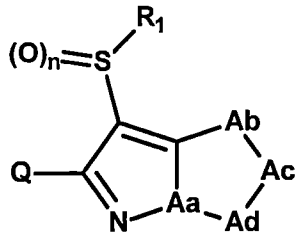
目前已發現新穎的稠合雙環雜環衍生物，這些衍生物具有優於已知化合物之優點，其實例包括較佳的生物或環境屬性、較廣範圍的應用方法、較佳的殺昆蟲或殺蟎作用以及對作物植物的良好相容性。此等稠合雙環雜環衍生物可用於與另外的試劑組合供增進效用，特別是對抗難以防治的昆

蟲。

本發明因此係提供新穎的式(I)或(I')化合物



(I)



(I')

其中(組態 1)

Aa 為氮或  (帶有一雙鍵連接 Ab 或 Ad 之碳原子),

Ab 為=N-、-S(O)_m-、-O-、-N(R⁷)-、=C(R²)-或-C(R⁹)(R¹⁰)-，

Ac 為=N-、-S(O)_m-、-O-、-N(R⁷)-、=C(R³)-或-C(R¹¹)(R¹²)-，

Ad 為=N-、-S(O)_m-、-O-、-N(R⁷)-、=C(R⁸)-或-C(R¹³)(R¹⁴)-，

其中僅有其中一個 Ab、Ac 或 Ad 取代基可為氧或-S(O)_m-，

R¹ 為(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)鹵烷基、(C₁-C₆)氰烷基、(C₁-C₆)羥烷基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)鹵基烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯基、(C₂-C₆)烯氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)鹵基烯氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)鹵烯基、(C₂-C₆)氰烯基、(C₂-C₆)炔基、(C₂-C₆)炔氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)鹵基炔氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)鹵炔基、(C₂-C₆)氰炔基、(C₃-C₈)環烷基、(C₃-C₈)環烷基-(C₃-C₈)環烷基、(C₁-C₆)烷基-(C₃-C₈)環烷基、鹵基(C₃-C₈)環烷基、胺基、(C₁-C₆)烷基胺基、二-(C₁-C₆)烷基胺基、(C₃-C₈)環烷基胺基、(C₁-C₆)烷基羰基胺基、(C₁-C₆)烷硫基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)鹵烷基硫基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基亞磺醯基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)鹵烷基亞磺醯基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基磺醯基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)鹵烷基磺醯基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷硫基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基亞磺醯基-(C₁-C₆)

烷基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基磺醯基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)鹵烷基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)鹵基烷氧基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基磺醯基胺基、胺基磺醯基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基胺基磺醯基-(C₁-C₆)烷基、二-(C₁-C₆)烷基胺基磺醯基-(C₁-C₆)烷基，

或在各情況下視需要單一或多重地，相同或不同地為經芳基-、雜芳基-或雜環基-取代的(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、(C₂-C₆)烯基、(C₂-C₆)炔基、(C₃-C₈)環烷基，其中芳基、雜芳基或雜環基可各自視需要相同或不同地經鹵素、氰基、硝基、羥基、胺基、羧基、胺甲醯基、胺基磺醯基、(C₁-C₆)烷基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)鹵烷基、(C₁-C₆)鹵基烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亞磺醯基、(C₁-C₆)烷基磺醯基、(C₁-C₆)烷基硫亞胺基(sulphimino)、(C₁-C₆)烷基硫亞胺基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基硫亞胺基-(C₂-C₆)烷基羰基、(C₁-C₆)烷基亞磺亞胺基(sulphoximino)、(C₁-C₆)烷基亞磺亞胺基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基亞磺亞胺基-(C₂-C₆)烷基羰基、(C₁-C₆)烷氧基羰基、(C₁-C₆)烷基羰基、(C₃-C₆)三烷基矽基或苯甲基單-或多取代，或

R¹ 為芳基、雜芳基或雜環基，各自視需要相同或不同地經鹵素、氰基、硝基、羥基、胺基、羧基、胺甲醯基、(C₁-C₆)烷基、(C₃-C₈)環烷基、(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)鹵烷基、(C₁-C₆)鹵基烷氧基、(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亞磺醯基、(C₁-C₆)烷基磺醯基、(C₁-C₆)烷基硫亞胺基、(C₁-C₆)烷基硫亞胺基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基硫亞胺基-(C₂-C₆)烷基羰基、(C₁-C₆)烷基亞磺亞胺基、(C₁-C₆)烷基亞磺亞胺基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基亞磺亞胺基-(C₂-C₆)烷基羰基、(C₁-C₆)烷氧基羰基、(C₁-C₆)烷基羰基、(C₃-C₆)三烷基矽基、(=O)(僅限於雜環基的情況下)或(=O)₂(僅限於雜環基的情況下)單-

或多取代，

R^2 、 R^3 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 獨立地為氫、氰基、鹵素、硝基、乙醯基、羥基、胺基、SCN、三-(C_1 - C_6)烷基矽基、(C_3 - C_8)環烷基、(C_3 - C_8)環烷基-(C_3 - C_8)環烷基、(C_1 - C_6)烷基-(C_3 - C_8)環烷基、鹵基(C_3 - C_8)環烷基、(C_1 - C_6)烷基、(C_1 - C_6)鹵烷基、(C_1 - C_6)氰烷基、(C_1 - C_6)羥烷基、羥基羰基-(C_1 - C_6)-烷氧基、(C_1 - C_6)烷氧基羰基-(C_1 - C_6)烷基、(C_1 - C_6)烷氧基-(C_1 - C_6)烷基、(C_2 - C_6)烯基、(C_2 - C_6)鹵烯基、(C_2 - C_6)氰基烯基、(C_2 - C_6)炔基、(C_2 - C_6)鹵炔基、(C_2 - C_6)氰基炔基、(C_1 - C_6)烷氧基、(C_1 - C_6)鹵基烷氧基、(C_1 - C_6)氰基烷氧基、(C_1 - C_6)烷氧基羰基-(C_1 - C_6)烷氧基、(C_1 - C_6)烷氧基-(C_1 - C_6)烷氧基、(C_1 - C_6)烷基羥基亞胺基、(C_1 - C_6)烷氧基亞胺基、(C_1 - C_6)烷基-(C_1 - C_6)烷氧基亞胺基、(C_1 - C_6)鹵烷基-(C_1 - C_6)烷氧基亞胺基、(C_1 - C_6)烷硫基、(C_1 - C_6)鹵基烷硫基、(C_1 - C_6)烷氧基-(C_1 - C_6)烷硫基、(C_1 - C_6)烷硫基-(C_1 - C_6)烷基、(C_1 - C_6)烷基亞磺醯基、(C_1 - C_6)鹵烷基亞磺醯基、(C_1 - C_6)烷氧基-(C_1 - C_6)烷基亞磺醯基、(C_1 - C_6)烷基亞磺醯基-(C_1 - C_6)烷基、(C_1 - C_6)烷基磺醯基、(C_1 - C_6)鹵烷基磺醯基、(C_1 - C_6)烷氧基-(C_1 - C_6)烷基磺醯基、(C_1 - C_6)烷基磺醯基-(C_1 - C_6)烷基、(C_1 - C_6)烷基磺醯基氧基、(C_1 - C_6)烷基羰基、(C_1 - C_6)烷硫基羰基、(C_1 - C_6)鹵烷基羰基、(C_1 - C_6)烷基羰基氧基、(C_1 - C_6)烷氧基羰基、(C_1 - C_6)鹵基烷氧基羰基、胺基羰基、(C_1 - C_6)烷基胺基羰基、(C_1 - C_6)烷基胺基硫羰基、二-(C_1 - C_6)烷基胺基羰基、二-(C_1 - C_6)烷基胺基硫羰基、(C_2 - C_6)烯基胺基羰基、二-(C_2 - C_6)-烯基胺基羰基、(C_3 - C_8)環烷基胺基羰基、(C_1 - C_6)烷基磺醯基胺基、(C_1 - C_6)烷基胺基、二-(C_1 - C_6)烷基胺基、胺基磺醯基、(C_1 - C_6)烷基胺基磺醯基、二-(C_1 - C_6)烷基胺基磺醯基、(C_1 - C_6)烷基亞磺亞胺基、胺基硫羰基、(C_1 - C_6)烷基胺基硫羰基、二-(C_1 - C_6)烷基胺基硫羰基、(C_3 - C_8)環烷基胺基或 $NHCO-(C_1-C_6)$ 烷基((C_1 - C_6)烷基羰基胺基)，

R⁷ 為氫、乙醯基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)羥烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)
氰烷基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)
烯基、(C₂-C₄)烯氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)鹵基烯氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)
鹵烯基、(C₂-C₄)氰基烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₂-C₄)炔氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)
鹵炔基氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)鹵炔基、(C₂-C₄)氰基炔基、(C₃-C₆)環烷
基、(C₁-C₄)烷基-(C₃-C₆)環烷基、鹵基(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷硫基-(C₁-C₄)
烷基、(C₁-C₄)鹵烷硫基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷基亞磺醯基-(C₁-C₄)烷基、
(C₁-C₄)鹵烷基亞磺醯基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷基磺醯基-(C₁-C₄)烷基、
(C₁-C₄)烷基羰基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基羰基-(C₁-C₄)烷基，

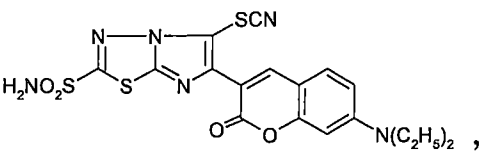
或在各情況下視需要單一或雙重，相同或不同地為經芳基-或雜環基-
取代的(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)炔基，其中芳基或雜環基可各自
視需要單一或雙重，相同或不同地經鹵素、氰基、(C₁-C₄)烷基、(C₃-C₄)
環烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基、(C₁-C₄)烷硫
基、(C₁-C₄)烷基亞磺醯基或(C₁-C₄)烷基磺醯基取代，

Q 為部分飽和或飽和的雜環或雜芳香 8-、9-、10-、11-或 12-員稠合雙
環或三環環系，其中可視需要存有至少一個羰基基團及/或該環系視需要
相同或不同地經單-或多取代，且其中該等取代基可獨立地選自氰基、鹵
素、硝基、乙醯基、羥基、胺基、SCN、三-(C₁-C₆)烷基矽基、(C₃-C₈)環
烷基、(C₃-C₈)環烷基-(C₃-C₈)環烷基、(C₁-C₆)烷基-(C₃-C₈)環烷基、鹵素(C₃-C₈)
環烷基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)鹵烷基、(C₁-C₆)氰烷基、(C₁-C₆)羥烷基、羥
基羰基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基
-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯基、(C₂-C₆)鹵烯基、(C₂-C₆)氰基烯基、(C₂-C₆)炔基、
(C₂-C₆)炔氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₆)鹵炔基、(C₂-C₆)氰基炔基、(C₁-C₆)烷氧
基、(C₁-C₆)鹵基烷氧基、(C₁-C₆)鹵基烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯氧基

-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)鹵基烯氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)氰基烷氧基、(C₁-C₆)
烷氧基羰基-(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷基羰
基亞胺基、(C₁-C₆)烷氧基亞胺基、(C₁-C₆)烷基-(C₁-C₆)烷氧基亞胺基、(C₁-C₆)
鹵烷基-(C₁-C₆)烷氧基亞胺基、(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)鹵烷硫基、(C₁-C₆)
烷氧基-(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷硫基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基亞磺醯基、
(C₁-C₆)鹵烷基亞磺醯基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基亞磺醯基、(C₁-C₆)烷
基亞磺醯基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基磺醯基、(C₁-C₆)鹵烷基磺醯基、(C₁-C₆)
烷氧基-(C₁-C₆)烷基磺醯基、(C₁-C₆)烷基磺醯基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基
磺醯基氧基、(C₁-C₆)烷基羰基、(C₁-C₆)烷基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷
硫基羰基、(C₁-C₆)鹵烷基羰基、(C₁-C₆)烷基羰基氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基、
(C₁-C₆)鹵基烷氧基羰基、胺基羰基、(C₁-C₆)烷基胺基羰基、(C₁-C₆)烷基胺
基硫羰基、二-(C₁-C₆)烷基胺基羰基、二-(C₁-C₆)烷基胺基硫羰基、(C₂-C₆)
烯基胺基羰基、二-(C₂-C₆)-烯基胺基羰基、(C₃-C₈)環烷基胺基羰基、(C₁-C₆)
烷基磺醯基胺基、(C₁-C₆)烷基胺基、二-(C₁-C₆)烷基胺基、胺基磺醯基、
(C₁-C₆)烷基胺基磺醯基、二-(C₁-C₆)烷基胺基磺醯基、(C₁-C₆)烷基亞磺亞
胺基、胺基硫羰基、(C₁-C₆)烷基胺基硫羰基、二-(C₁-C₆)烷基胺基硫羰基、
(C₃-C₈)環烷基胺基、NHCO-(C₁-C₆)烷基((C₁-C₆)烷基羰基胺基)，

或其中該等取代基可獨立地選自苯基或 5-或 6-員雜芳香環，其中苯基
或該環可視需要相同或不同地經 C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、
C₃-C₆-環烷基、C₁-C₆-鹵烷基、C₂-C₆-鹵烯基、C₂-C₆-鹵炔基、C₃-C₆-鹵基環
烷基、鹵素、CN、NO₂、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-鹵基烷氧基單-或多取代，

n 為 0、1 或 2，
m 為 0、1 或 2，



不包括

根據 Aa、Ab、Ac、Ad 取代基之定義，結果為芳香、飽和或部分保合環。

另外已發現式(I)或(I')化合物具有作為除害劑之非常良好的效用，較佳地係作為殺昆蟲劑及/或殺蟎劑，及另外一般而言係具有非常良好的植物相容性，特別是在有關作物植物方面。

本發明之化合物係藉由式(I)或(I')以通用術語來定義。就列於上文和下文所提及之化學式中的基團，較佳的取代基或範圍係說明於下文中：

組態 2

Aa 較佳地為氮，

Ab 較佳地為=N-、-S(O)_m-、-O-、-N(R⁷)-、=C(R²)-或-C(R⁹)(R¹⁰)-，

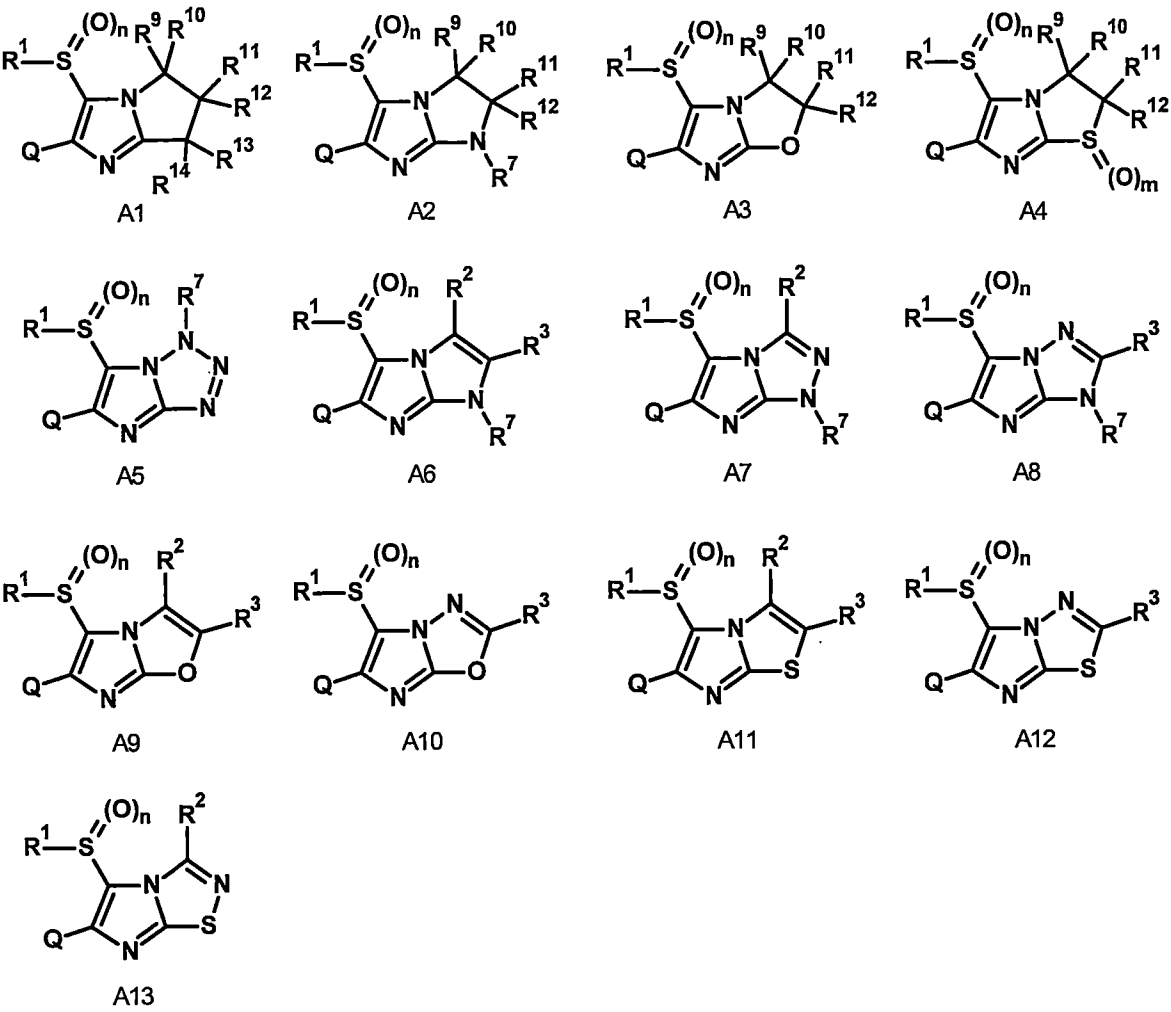
Ac 較佳地為=N-、-S(O)_m-、=C(R³)-或-C(R¹¹)(R¹²)-，

Ad 較佳地為 =N- 、 -S(O)_m- 、 -O- 、 -N(R⁷)- 、 =C(R⁸)- 或 -C(R¹³)(R¹⁴)-，

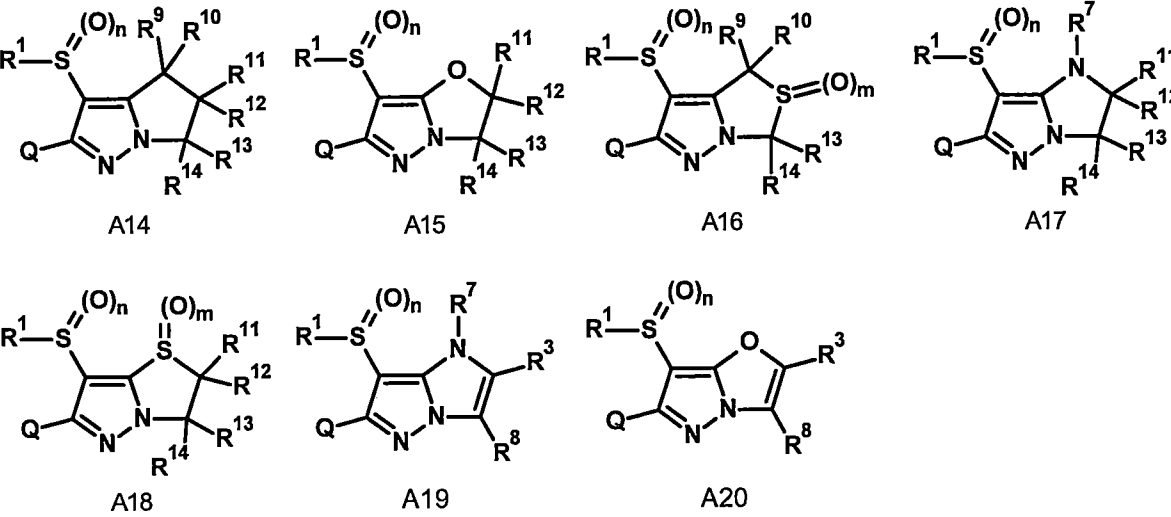
其中僅一個 Ab、Ac 或 Ad 取代基可為氧或-S(O)_m-，

較佳地係產生下列 A1 至 A20 結構單元：

(I):



(I'):



R¹ 較佳地為(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)羧烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₂-C₄)烯基、
(C₂-C₄)鹵烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₂-C₄)鹵炔基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷硫
基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷硫基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷基亞磺醯基-(C₁-C₄)
烷基、(C₁-C₄)烷基磺醯基-(C₁-C₄)烷基，

或在各情況下視需要單一或雙重、相同或不同地為經芳基-或雜環基-取代的(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₃-C₆)環烷基，其中芳基或雜環基可各自視需要單一或雙重、相同或不同地經鹵素、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₃-C₄)環烷基、(C₁-C₄)烷氧基或(C₁-C₄)烷硫基取代，或

R¹ 較佳地為芳基、雜芳基或雜環基，各自視需要相同或不同地經鹵素、氰基、(C₁-C₄)烷基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基、(C₁-C₄)烷硫基、(=O)(僅限於雜環基的情況下)或(=O)₂(僅限於雜環基的情況下)單或雙取代，

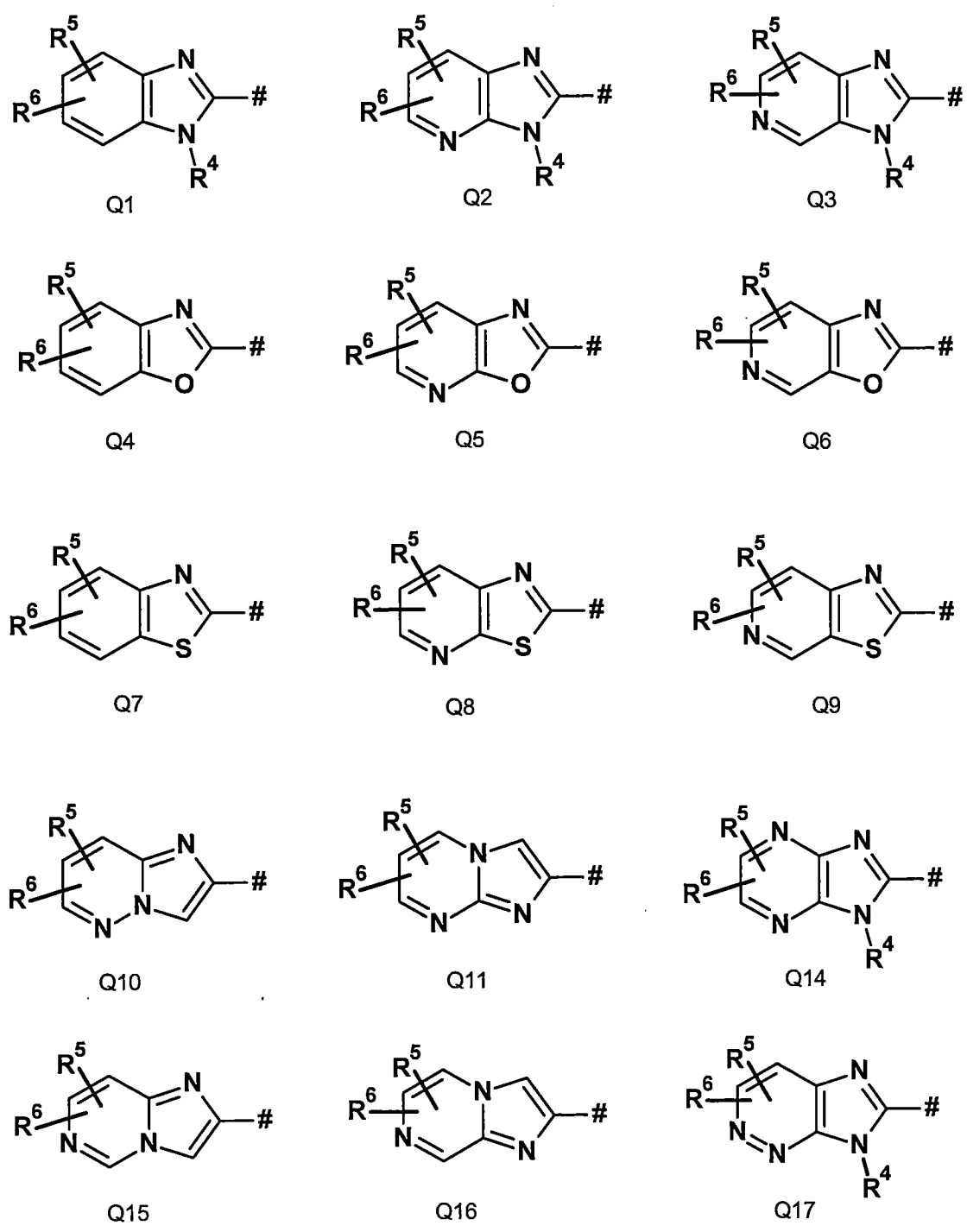
R²、R³、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴ 較佳獨立地為氫、氰基、鹵素、硝基、羥基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷基-(C₃-C₆)環烷基、鹵基(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)氰烷基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)鹵烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₂-C₄)鹵炔基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基、(C₁-C₄)烷硫基、(C₁-C₄)鹵烷硫基、(C₁-C₄)烷基亞磺醯基、(C₁-C₄)鹵烷基亞磺醯基、(C₁-C₄)烷基磺醯基、(C₁-C₄)鹵烷基磺醯基、(C₁-C₄)烷基羰基、(C₁-C₄)鹵烷基羰基、胺基羰基、(C₁-C₄)烷基胺基羰基、二-(C₁-C₄)烷基胺基羰基、(C₁-C₄)烷基磺醯基胺基、(C₁-C₄)烷基胺基、二-(C₁-C₄)烷基胺基、胺基磺醯基、(C₁-C₄)烷基胺基磺醯基、二-(C₁-C₄)烷基胺基磺醯基或 NHCO-(C₁-C₄)烷基((C₁-C₄)烷基羰基胺基)，

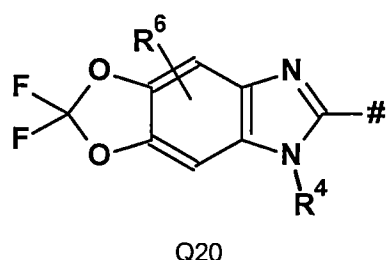
R⁷ 較佳地為氫、乙醯基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)氰烷基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷基-(C₃-C₆)環烷基、鹵基(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷硫基-(C₁-C₄)烷基，

或在各情況下視需要單一或雙重地、相同或不同地為經芳基-或雜環基-取代的(C₁-C₄)烷基，其中芳基或雜環基可各自視需要單一或雙重地，相同或

不同地經鹵素、(C₁-C₄)烷基、氰基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷基或(C₁-C₄)鹵基烷氧基取代，

Q 較佳地為來自 Q1 至 Q11、Q14 至 Q17 或 Q20 基群之雜芳香 9-員或 12-員稠合雙環或三環環系，





R⁴ 較佳地為(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)氰烷基、(C₁-C₄)羥烷基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)烯氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)鹵基烯氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)鹵烯基、(C₂-C₄)氰基烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₂-C₄)炔氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)鹵炔基、(C₃-C₆)環烷基、(C₃-C₆)環烷基-(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷基-(C₃-C₆)環烷基、鹵基(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷硫基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷基亞磺醯基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷基磺醯基-(C₁-C₄)烷基或(C₁-C₄)烷基羰基-(C₁-C₄)烷基，

R⁵、R⁶ 較佳獨立地為氫、氰基、鹵素、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)鹵烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₂-C₄)鹵炔基、(C₃-C₆)環烷基、(C₃-C₆)環烷基-(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷基-(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基、(C₁-C₄)烷氧基亞胺基、(C₁-C₄)烷硫基、(C₁-C₄)鹵烷硫基、(C₁-C₄)烷基亞磺醯基、(C₁-C₄)鹵烷基亞磺醯基、(C₁-C₄)烷基磺醯基、(C₁-C₄)鹵烷基磺醯基、(C₁-C₄)烷基磺醯基氧基、(C₁-C₄)烷基羰基、(C₁-C₄)鹵烷基羰基、胺基羰基、(C₁-C₄)烷基胺基羰基、二-(C₁-C₄)烷基胺基羰基、(C₁-C₄)烷基磺醯基胺基、(C₁-C₄)烷基胺基、二-(C₁-C₄)烷基胺基、胺基磺醯基、(C₁-C₄)烷基胺基磺醯基或二-(C₁-C₄)烷基胺基磺醯基，

n 較佳地為 0、1 或 2，

m 較佳地為 0、1 或 2。

組態 3

Aa 更佳地為氫，

Ab 更佳地為 $=N-$ 、 $-O-$ 、 $-N(R^7)-$ 或 $=C(R^2)-$ ，

Ac 更佳地為 $=N-$ 或 $=C(R^3)-$ ，

Ad 更佳地為 $=N-$ 、 $-S(O)_m-$ 、 $-O-$ 、 $-N(R^7)-$ 或 $=C(R^8)-$ ，

其中僅一個 Ab 或 Ad 取代基可為氧或 $-S(O)_m-$ ，

更佳地係產生下列結構單元：A5、A6、A7、A8、A9、A10、A11、A12、A13、A19、A20，

R^1 更佳地為 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 鹵烷基或 (C_3-C_6) 環烷基，

R^2 、 R^3 、 R^8 更佳地獨立為氫、氰基、鹵素、硝基、羥基、 (C_3-C_6) 環烷基、 (C_1-C_4) 烷基- (C_3-C_6) 環烷基、鹵基 (C_3-C_6) 環烷基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 鹵烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 鹵基烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 鹵烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基亞磺醯基、 (C_1-C_4) 鹵烷基亞磺醯基、 (C_1-C_4) 烷基磺醯基、 (C_1-C_4) 鹵烷基磺醯基、胺基磺醯基、 (C_1-C_4) 烷基胺基磺醯基、二- (C_1-C_4) 烷基胺基磺醯基或 $NHCO-(C_1-C_4)$ 烷基 $((C_1-C_4)$ 烷基羰基胺基)，

R^7 更佳地為氫、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 鹵烷基、 (C_1-C_4) 氰烷基或 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基，

Q 更佳地為選自 Q1、Q2、Q3、Q4、Q5、Q6、Q8、Q9、Q10、Q15、Q17 基群之雜芳香 9-員稠合雙環環系，

R^4 更佳地為 (C_1-C_4) 烷基或 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基，

R^5 更佳地為鹵素、 (C_1-C_4) 鹵烷基、 (C_1-C_4) 鹵基烷氧基或 (C_1-C_4) 鹵烷硫基，

R^6 更佳地為氫，

n 更佳地為 0、1 或 2，

m 更佳地為 0。

組態 4

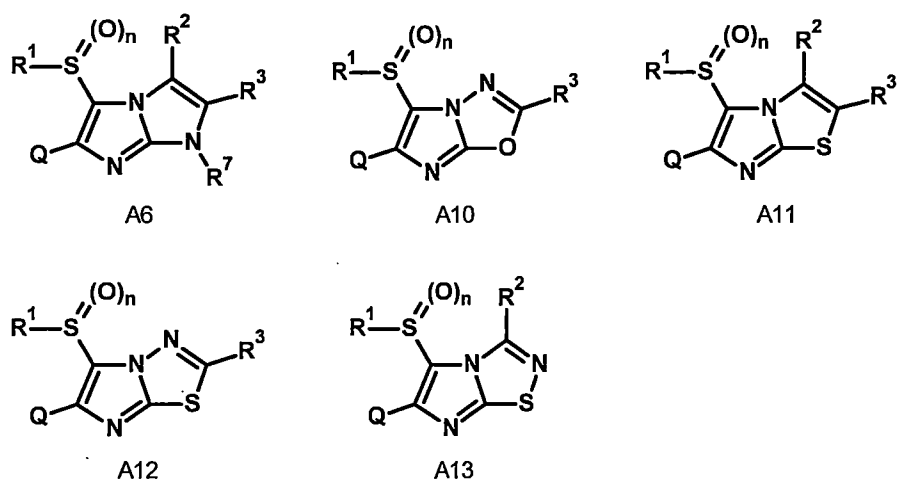
Aa 更佳地為氮，

Ab 更佳地為 =N-或=C(R²)-，

Ac 更佳地為=N-或=C(R³)-，

Ad 更佳地為-S(O)_m-、-O-或-N(R⁷)-，

更佳地係產生下列結構單元：A6、A10、A11、A12、A13，

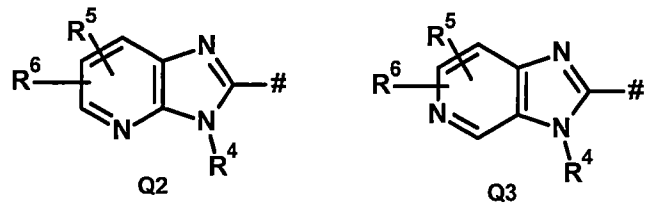


R¹ 更佳地為乙基，

R²、R³ 更佳地獨立為氫、氟、氯、溴、碘、氰基、甲基、乙基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基或三氟甲基硫基，

R⁷ 更佳地為氫、甲基、乙基、正丙基、異丙基、第二丙基或第三丁基，

Q 更佳地為選自 Q2 或 Q3 基群之雜芳香 9-員稠合雙環環系，



R⁴ 更佳地為甲基、乙基、異丙基、甲氧基甲基或甲氧基乙基，

R⁵ 更佳地為氟、氯、溴、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟乙基 (CH₂CFH₂、CHFCH₃)、二氟乙基 (CF₂CH₃、CH₂CHF₂、CHFCHF₂)、三氟

乙基(CH_2CF_3 、 CHFCHF_2 、 CF_2CFH_2)、四氟乙基(CHFCF_3 、 CF_2CHF_2)、五
 氟乙基、三氟甲氧基、二氟一氯甲氧基、二氟一氯甲氧基或三氟甲硫基，

R^6 甚佳地為氫，

n 甚佳地為 0、1 或 2，

m 甚佳地為 0。

組態 5-1

Aa 特言之為氮，

Ab 特言之為 $=\text{C}(\text{R}^2)-$ ，

Ac 特言之為 $=\text{C}(\text{R}^3)-$ ，

Ad 特言之為 $-\text{S}(\text{O})_m-$ ，

特言之係產生下列結構單元：A11，

R^1 特言之為乙基，

R^2 、 R^3 特言之為氫，

Q 特言之為選自 Q3 基團之雜芳香 9-員稠合雙環環系

R^4 特言之為甲基，

R^5 特言之為三氟甲基，

R^6 特言之為氫，

n 特言之為 0 或 2，

m 特言之為 0。

組態 5-2

Aa 特言之為氮，

Ab 特言之為 $=\text{C}(\text{R}^2)-$ ，

Ac 特言之為 $=\text{C}(\text{R}^3)-$ ，

Ad 特言之為 $-\text{S}(\text{O})_m-$ ，

特言之係產生下列結構單元：A11，

R^1 特言之為乙基，

R^2 特言之為氫，

R^3 特言之為氫，

Q 特言之為選自 Q3 基團之雜芳香 9-員稠合雙環環系，

R^4 特言之為甲基，

R^5 特言之為三氟甲基，

R^6 特言之為氫，

n 特言之為 0 或 2，

m 特言之為 0。

組態 6-1

Aa 特言之為氮，

Ab 特言之為 $-C(R^9)(R^{10})-$ ，

Ac 特言之為 $-C(R^{11})(R^{12})-$ ，

Ad 特言之為 $-C(R^{13})(R^{14})-$ ，

特言之係產生下列結構單元：A1，

且 Q、 R^1 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 和 n 係具有組態 1 中所給予之定義。

組態 6-2

Aa 特言之為氮，

Ab 特言之為 $-C(R^9)(R^{10})-$ ，

Ac 特言之為 $-C(R^{11})(R^{12})-$ ，

Ad 特言之為 $-C(R^{13})(R^{14})-$ ，

特言之係產生下列結構單元：A1，

且 Q 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 和 n 係具有組態 2 中所給予之定義。

組態 6-3

Aa 特言之為氮，

Ab 特言之為 $-C(R^9)(R^{10})-$ ，

Ac 特言之為 $-C(R^{11})(R^{12})-$ ，

Ad 特言之為 $-C(R^{13})(R^{14})-$ ，

特言之係產生下列結構單元：A1，

R^1 特言之為 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 鹵烷基或 (C_3-C_6) 環烷基，

R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 特言之獨立地為氫、 (C_1-C_4) 烷基或 (C_1-C_4) 鹵烷基，

Q 特言之為選自 $Q1$ 、 $Q2$ 、 $Q3$ 、 $Q4$ 、 $Q5$ 、 $Q6$ 、 $Q8$ 、 $Q9$ 、 $Q10$ 、 $Q15$ 、 $Q17$ 基群之 9-員稠合雙環環系，

R^4 特言之為 (C_1-C_4) 烷基或 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基，

R^5 特言之為鹵素、 (C_1-C_4) 鹵烷基、 (C_1-C_4) 鹵基烷氧基或 (C_1-C_4) 鹵烷硫基，

R^6 特言之為氫，

n 特言之為 0、1 或 2。

組態 6-4

Aa 特言之為氮，

Ab 特言之為 $-C(R^9)(R^{10})-$ ，

Ac 特言之為 $-C(R^{11})(R^{12})-$ ，

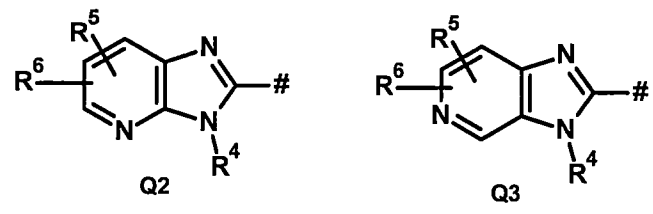
Ad 特言之為 $-C(R^{13})(R^{14})-$ ，

特言之係產生下列結構單元：A1，

R¹ 特言之為乙基，

R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴ 特言之獨立地為氫、甲基或乙基，

Q 特言之為來自 Q2 或 Q3 基群之雜芳香 9-員稠合雙環環系



R⁴ 特言之為甲基、乙基、異丙基、甲氧基甲基或甲氧基乙基，

R⁵ 特言之為氟、氯、溴、一氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、一氟乙基 (CH₂CFH₂、CHFCH₃)、二氟乙基 (CF₂CH₃、CH₂CHF₂、CHFCHF₂)、三氟乙基 (CH₂CF₃、CHFCHF₂、CF₂CFH₂)、四氟乙基 (CHFCH₂CF₃、CF₂CHF₂)、五氟乙基、三氟甲氧基、二氟一氯甲氧基、二氯一氟甲氧基或三氟甲硫基、

R⁶ 特言之為氫，

n 特言之為 0、1 或 2。

組態 6-5

Aa 特言之為氮，

Ab 特言之為 -C(R⁹)(R¹⁰)-，

Ac 特言之為 -C(R¹¹)(R¹²)-，

Ad 特言之為 -C(R¹³)(R¹⁴)-，

特言之係產生下列結構單元：A1，

R¹ 特言之為乙基，

R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴ 特言之為氫，

Q 特言之為來自 Q3 基團之雜芳香 9-員稠合雙環環系

R⁴ 特言之為甲基，

R⁵ 特言之為三氟甲基，

R^6 特言之為氫，

n 特言之為 2。

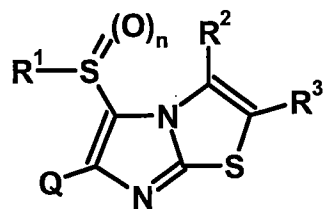
在一較佳的實施例中，本發明係關於式(I)化合物，其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 Q 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 n 和 m 係具有組態(1)中所給予之定義。

在一較佳的實施例中，本發明係關於式(I)化合物，其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 Q 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 n 和 m 係具有組態(2)或組態(3)或組態(4)或組態(5-1)或組態(5-2)或組態(6-1)或組態(6-2)或組態(6-3)或組態(6-4)或組態(6-5)中所給予之定義。

在一較佳的實施例中，本發明係關於式(I')化合物，其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 Q 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 n 和 m 係具有組態(1)中所給予之定義。

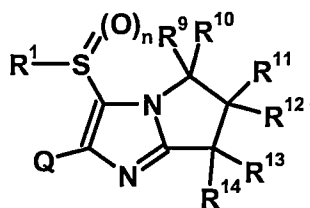
在一較佳的實施例中，本發明係關於式(I')化合物，其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 Q 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 n 和 m 係具有組態(2)或組態(3)或組態(4)或組態(5-1)或組態(5-2)或組態(6-1)或組態(6-2)或組態(6-3)或組態(6-4)或組態(6-5)中所給予之定義。

在一較佳的實施例中，本發明係關於結構單元 A11 之式(I)化合物



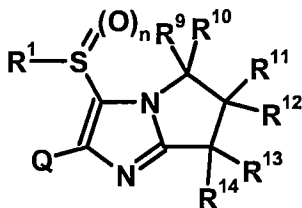
其中 Q 為 $Q3$ 而 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 和 n 係具有組態(2)或組態(3)或組態(4)或組態(5-1)或組態(5-2)中所給予之定義。

在一較佳的實施例中，本發明係關於結構單元 A1 之式(I)化合物



其中 Q、R¹、R⁴、R⁵、R⁶、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴ 和 n 係具有組態(6-1)或組態(6-2)或組態(6-3)或組態(6-4)或組態(6-5)中所給予之定義。

在一較佳的實施例中，本發明係關於結構單元 A1 之式(I)化合物



其中 Q 為 Q3 而 R¹、R⁴、R⁵、R⁶、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴ 和 n 係具有組態(6-2)或組態(6-3)或組態(6-4)或組態(6-5)中所給予之定義。

在較佳的定義中，除非另有說明，否則

鹵素係選自氟、氯、溴和碘之群，較佳地依次係選自氟、氯和溴之群。

在特佳的定義中，除非另有說明，否則鹵素係選自氟、氯、溴和碘之群，較佳地依次係選自氟、氯和溴之群。

在本發明內文中，除非另有不同地定義，否則術語「烷基」其本身或與另外的術語組合，例如鹵烷基，應了解係指飽和的脂系烴基，其係具有 1 至 12 個碳原子且可為支鏈或非支鏈。C₁-C₁₂ 烷基之實例有甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、第二丁基、第三丁基、正戊基、異戊基、新戊基、第三戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、1-乙基丙基、1,2-二甲基丙基、己基、正庚基、正辛基、正壬基、正癸基、正十一基和正十二基。在這些烷基中，特佳地係給予 C₁-C₆-烷基。特佳的為 C₁-C₄-烷基。

根據本發明，除非另有不同地定義，否則術語「烯基」其本身或與另外的術語組合，應了解係指具有至少一個雙鍵之直鏈或支鏈 C₂-C₁₂-烯基，

例如乙烯基、烯丙基、1-丙烯基、異丙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1,3-丁二烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1,3-戊二烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基和 1,4-己二烯基。在這些之中，較佳的係給予 C₂-C₆-烯基及特佳的係給予 C₂-C₄-烯基。

根據本發明，除非另有不同的定義，否則術語「炔基」其本身或與另外的術語組合，應了解係指具有至少一個叁鍵之直鏈或支鏈 C₂-C₁₂-炔基，例如乙炔基、1-丙炔基和炔丙基。在這些之中，較佳的係給予 C₃-C₆-炔基及特佳的係給予 C₃-C₄ 炔基。炔基亦可含有至少一個雙鍵。

根據本發明，除非另有不同地定義，否則術語「環烷基」其本身或與另外的術語組合，應了解係指 C₃-C₈-環烷基，例如環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基和環辛基。在這些之中，較佳的係給予 C₃-C₆-環烷基。

術語「烷氧基」其本身或與另外的術語組合，例如鹵基烷氧基，在本應了解係指 O-烷基，其中術語「烷基」係如上所定義。

經鹵素-取代的基團，例如鹵烷基，為單-或多鹵素化，至高可能取代基的最大數目。在多鹵素化之情況下，鹵素原子可相同或不同。在此情況下，鹵素為氟、氯、溴或碘，特別是氟、氯或溴。

除非另有說明，否則視需要經取代基團可為單-或多取代，其中在多取代的情況下，取代基可相同或不同。

在通用術語中所給予的或列於較佳區域之基團定義或說明相應地係應用於最終產物和起始物及中間物。這些基團定義若需要可彼此組合，亦即包括個別較佳範圍間的組合。

較佳的依照本發明係使用式(I)或(I')化合物，其中係呈現上文所列為較佳定義之組合。

特佳的依照本發明係使用式(I)或(I')化合物，其中係呈現上文所列為更

佳定義之組合。

非常特佳的依照本發明係使用式(I)或(I')化合物，其中係呈現上文所列為甚佳定義之組合。

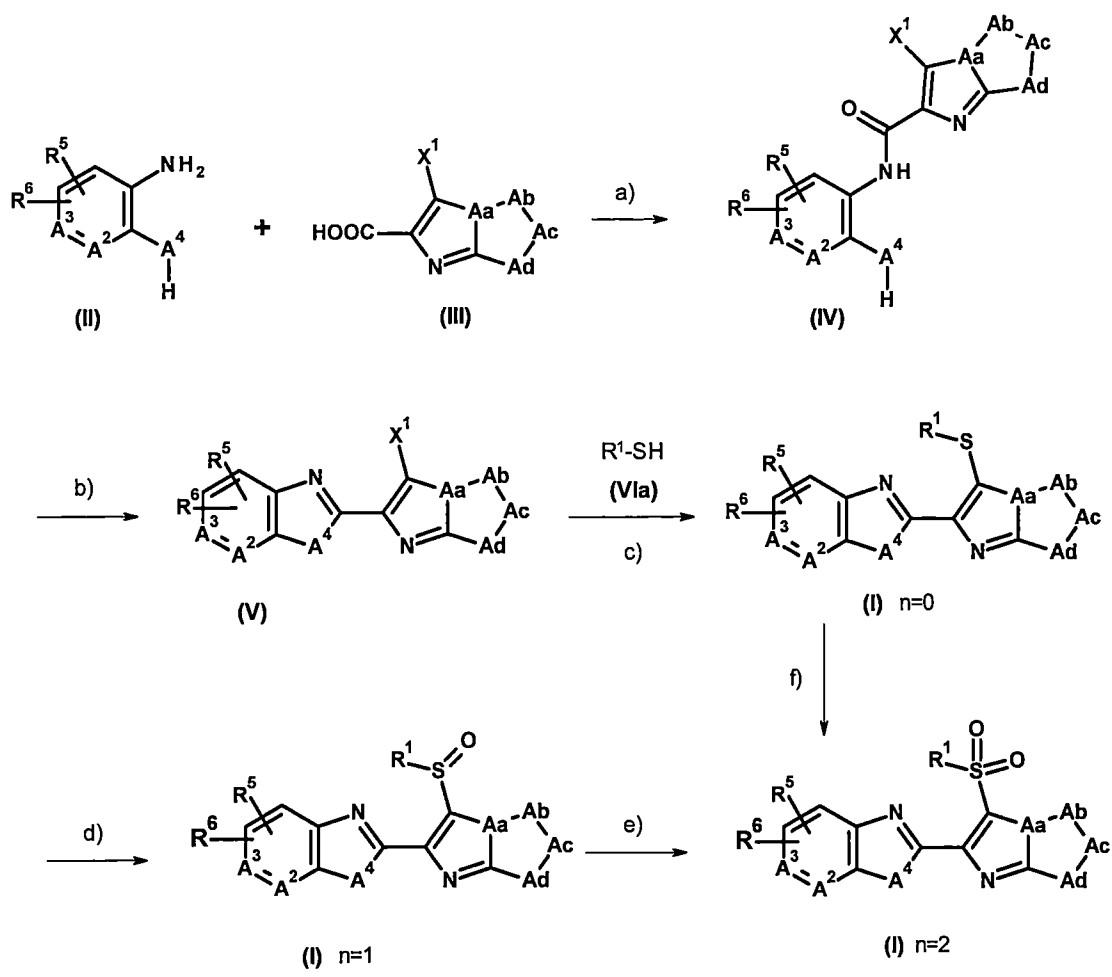
特佳的依照本發明係使用式(I)或(I')化合物，其中係呈現上文所列為更佳定義之組合。

依照取代基的性質，式(I)或(I')化合物可為幾何及/或光學活性異構物或不同組成之對應的異構物混合物。這些立體異構物有，例如鏡像異構物、非對映異構物、構型異構物(atropisomer)或幾何異構物。本發明因此係涵蓋純的立體異構物及這些異構物之任何所欲的混合物。

本發明之式(I)或(I')化合物可藉由下列流程圖中所示的方法來製得：

方法 A-1

其中 Q 為 Q1 至 Q9 或 Q20 之式(I)化合物可藉由已知的方法來製備，例如類似 WO2009/131237、WO2010/125985、WO2011/043404、WO2011/040629、WO2012/086848、WO2013/018928、WO2015/000715 和 WO2015/121136 中所述的方法。



R¹、R⁴、R⁵、R⁶、Aa、Ab、Ac、Ad 基和 n 係具有上述定義，A²和 A³ 為 CH 或 N (其中 A²和 A³不能同時為 N)，A⁴為 O、S 或 N-R⁴而 X¹為鹵素。

步驟 a)

式(IV)之化合物可以類似 US5576335 中所述的方法，藉由將式(II)之化合物與式(III)之羧酸在縮合劑或鹼之存在下反應，加以製備。

式(II)之化合物可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 US2003/69257、WO2006/65703、WO2009/131237、WO2010/125985、WO2011/043404、WO2011/040629、WO2012/086848、WO2013/018928 或 WO2015/000715 中所述的方法。

式(III)之羧酸可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備。可能的製備途徑係描述於方法 E、F 和 G 中。

式(II)之化合物與式(III)之羧酸的反應可不加溶劑或在溶劑中進行，較

佳的係在選自習用的溶劑中進行反應，而該習用溶劑在當時的反應條件下為惰性的。較佳的係給予醚類，例如異丙醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧基乙烷；鹵化烴類，例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯；腈類，例如乙腈或丙腈；芳香烴類，例如甲苯或二甲苯；非質子極性溶劑，例如 N,N-二甲基甲醯胺或 N-甲基吡咯酮，或含氮化合物，例如吡啶。

適合的縮合劑有，例如碳二亞胺例如 1-(3-二甲基胺基丙基)-3-乙基碳二亞胺鹽酸鹽(EDCI)或 1,3-二環己基碳二亞胺。

適合的鹼為典型用於此等反應中之無機鹼。較佳的係使用例如由鹼金屬或鹼土金屬之乙酸鹽、磷酸鹽、碳酸鹽和碳酸氫鹽組成之群中選出的鹼。特佳的在本處係給予乙酸鈉、磷酸鈉、磷酸鉀、碳酸銨、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鈉、碳酸氫鉀。

此反應可在降低的壓力下、標準壓力或升高的壓力下及於 0°C 至 180°C 的溫度下進行；其中較佳的，此反應係在標準的壓力及 20 至 140°C 之溫度下進行。

步驟 b)

式(V)之化合物可藉由將式(IV)化合物縮合來製備，例如類似 WO2009/131237、WO2010/125985、WO2011/043404、WO2011/040629、WO2012/086848、WO2013/018928、WO2015/000715 和 WO2015/121136 中所述的方法。

式(V)化合物之轉化可不加溶劑或在溶劑中進行，較佳的係在選自習用的溶劑中進行反應，而該習用溶劑在當時的反應條件下為惰性的。較佳的係給予醚類，例如異丙醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、第三丁基甲基醚；鹵化烴類，例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯；腈類，例如乙腈或丙腈；芳香烴類，例如甲苯或二甲苯；非質子極性

溶劑，例如 N,N-二甲基甲醯胺或 N-甲基吡咯酮，或氮化合物，例如吡啶。

此反應可在縮合劑、酸、鹼或氯化劑之存在下進行。

適合的縮合劑之實例有碳二亞胺，例如 1-(3-二甲基胺基丙基)-3-乙基碳二亞胺鹽酸鹽(EDCI)或 1,3-二環己基碳二亞胺；酸酐，例如乙酸酐、三氟乙酸酐；三苯基磷、鹼和四氯化碳之混合物，或三苯基磷和偶氮二酯，例如偶氮二甲酸二乙酯之混合物。

可用於所述反應中之適合的酸之實例有磺酸，例如對甲苯磺酸；羧酸，例如乙酸或多磷酸。

適合的鹼之實例有氮雜環類，例如吡啶、甲基吡啶、2,6-二甲基吡啶、1,8-二氮雜雙環[5.4.0]-7-十一烯(DBU)；三級胺，例如三乙胺和 N,N-二異丙基乙基胺；無機鹼，例如磷酸鉀、碳酸鉀和氫化鈉。

適合的氯化劑之實例為氧氯化磷。

此反應可在降低的壓力下、標準壓力或升高的壓力下及於 0°C 至 200°C 的溫度下進行。

步驟 c)

其中 n 為 0 之式(I)化合物可藉由將式(V)化合物與式(VIa)化合物在鹼的存在下反應，加以製備。

式(VIa)之硫醇衍生物，例如甲硫醇、乙硫醇、或異丙基硫醇可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 US2006/25633、US2006/111591、US2820062、Chemical Communications, **13** (2000), 1163-1164 或 Journal of the American Chemical Society, **44** (1922), p. 1329 中所述的方法。

轉化成其中 n 為 0 之式(I)化合物可不加溶劑或在溶劑中進行，較佳的係在選自習用的溶劑中進行反應，而該習用溶劑在當時的反應條件下為惰

性的。較佳的係給予醚類，例如異丙醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、第三丁基甲基醚；腈類，例如乙腈或丙腈；芳香烴類，例如甲苯或二甲苯；非質子極性溶劑，例如 N,N-二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯酮或二甲基亞砷。

適合的鹼之實例為由鹼金屬或鹼土金屬之乙酸鹽、磷酸鹽、碳酸鹽和碳酸氫鹽組成之群中選出的無機鹼。特佳的在本處係給予碳酸銨、碳酸鈉和碳酸鉀。另外適合的鹼有鹼金屬氫化物，例如氫化鈉。

此反應可在降低的壓力下、標準壓力或升高的壓力下及於 0°C 至 200°C 的溫度下進行。

在所述的反應中，X¹ 較佳地為氟或氯原子。

步驟 d)

其中 n 為 1 之式(I)化合物可藉由將其中 n 為 0 之式(I)化合物氧化來製備。此氧化一般係在選自習用溶劑之溶劑中進行，而該習用溶劑在當時的反應條件下為惰性的。較佳的係給予鹵化烴類，例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯；醇類，例如甲醇或乙醇；甲酸、乙酸、丙酸或水。

適合的氧化劑之實例有過氧化氫、間-氯過氧苯甲酸或過碘酸鈉。

反應可在降低的壓力下、標準壓力或升高的壓力下及於 -20°C 至 120°C 的溫度下進行。

步驟 e)

其中 n 為 2 之式(I)化合物可藉由將其中 n 為 1 之式(I)化合物氧化來製備。此氧化一般係在溶劑中進行。較佳的係給予鹵化烴類，例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯；醇類，例如甲醇或乙醇；甲酸、乙酸、丙酸或水。

適合的氧化劑之實例有過氧化氫和間-氯過氧苯甲酸。

反應可在降低的壓力下、標準壓力或升高的壓力下及於-20°C 至 120°C 的溫度下進行。

步驟 f)

其中 n 為 2 之式(I)化合物亦可用一步法，藉由將其中 n 為 0 之式(I)化合物氧化來製備。此氧化一般係在溶劑中進行。較佳的係給予鹵化烴類，例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯；醇類，例如甲醇或乙醇；甲酸、乙酸、丙酸或水。

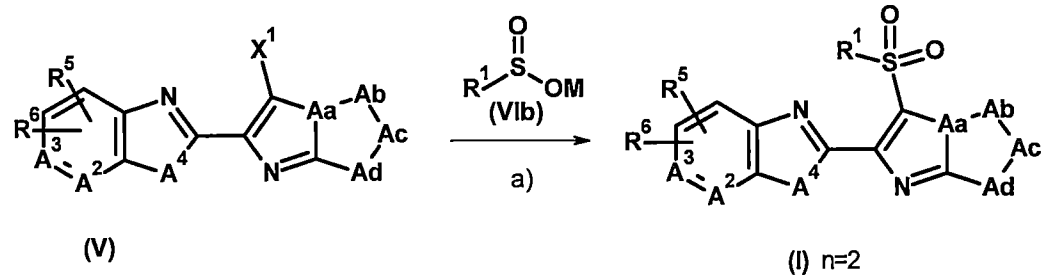
適合的氧化劑之實例有過氧化氫和間-氯過氧苯甲酸。

反應可在降低的壓力下、標準壓力或升高的壓力下及於-20°C 至 120°C 的溫度下進行。

其中 Q 為 Q1 至 Q9 或 Q20 之式(I')化合物可同樣地類似方法 A 來製備，由對應的式(III')之羧酸著手進行，其可能的製備路徑係描述於方法 H、I 和 J 中。

方法 A-2

其中 Q 為 Q1 至 Q9、Q17 或 Q20 之式(I)化合物可藉由已知的方法來製備，例如類似 WO2009/131237、WO2010/125985、WO2011/043404、WO2011/040629、WO2012/086848、WO2013/018928、WO2015/000715 和 WO2015/121136 中所述之方法。



R¹、R⁴、R⁵、R⁶、Aa、Ab、Ac、Ad 基和 n 係具有上述之定義，A²和

A^3 為 CH 或 N， A^4 為 O、S 或 N- R^4 ，M 為鋰、鈉或鉀，而 X^1 為鹵素。

步驟 a)

另一種選擇，其中 n 為 2 之式(II)化合物亦可用單階段製程來製備，例如類似 *Journal of Organic Chemistry* 2005, 70, 2696-2700 中所描述的方法，藉由鹵素-硼與式(VIb)化合物交換，由式(V)化合物著手進行。此交換一般係在溶劑中進行。較佳的係使用極性非質子溶劑，例如二甲基亞砷和 N,N-二甲基甲醯胺。

式(VIb)化合物可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 *Organic Synthesis* 1977, 57, 88-92；*Tetrahedron Letters* 1979, 9, 821-824 和 *Bulletin de la Societe Chimique de France* 1958, 4, 447-450 中所述之方法。

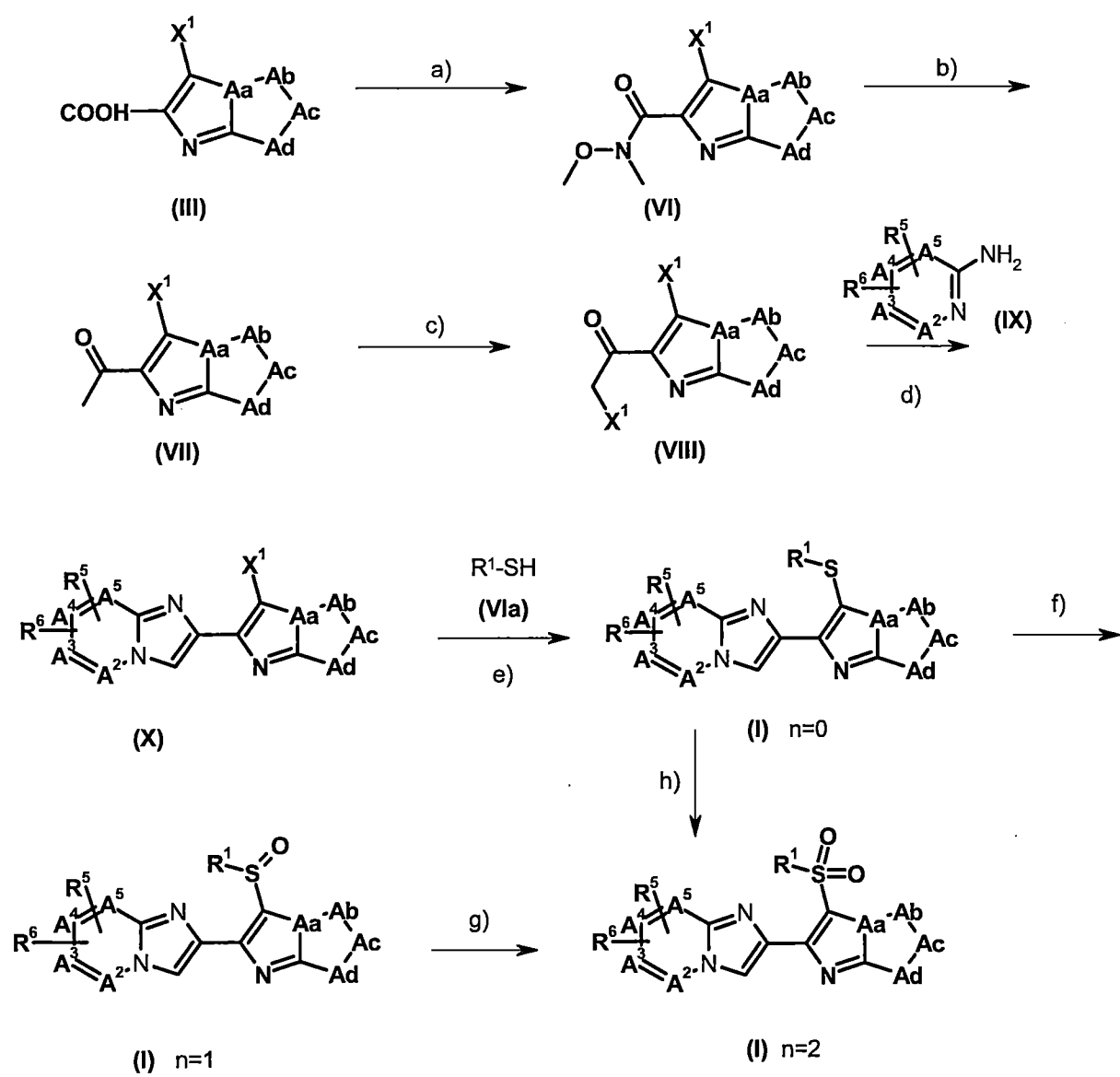
適合的硫試劑之實例有亞磺酸之鋰鹽、鈉鹽或鉀鹽。

反應可在降低的壓力下、標準壓力或升高的壓力下及於 -20°C 至 120°C 的溫度下進行。

其中 Q 為 Q1 至 Q9、Q17 或 Q20 之式(I')化合物可同樣類似方法 A-2 加以製備。

方法 B-1

其中 Q 為 Q10、Q11、Q15 或 Q16 之式(I)化合物可藉由已知的方法來製備，例如類似 US2009/203705、US2012/258951、WO2013/3298 或 *J. Med. Chem.* **31**, (1988) 1590-1595 中所述之方法。



R^1 、 R^5 、 R^6 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 基和 n 具有上述之定義。 A^2 、 A^3 、 A^4 和 A^5 為 CH 或 N(其中 A^2 、 A^3 、 A^4 和 A^5 不能同時為 N)而 X^1 為鹵素。

步驟 a)

式(III)之羧酸可用類似 WO2011/75643 或 EP2671582 中所述的方法，在 O,N-二甲基羥基胺鹽酸鹽的存在下轉變成式(VI)之溫勒伯醯胺(Weinreb amide)。

式(III)之羧酸可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備。可能的製備路徑係描述於方法 E、F 和 G 中。

步驟 b, c)

然後式(VI)化合物可藉由已知的方法，例如類似 WO2011/75643 中所述

的方法，以格任亞試劑(Grignard reagent)，例如甲基溴化鎂，轉化成式(VII)之酮。藉由後續的鹵化作用，類似 US2012/302573 中所述之已知方法，得到式(VIII)化合物。

步驟 d)

式(X)之化合物可藉由將式(VIII)化合物以式(IX)之胺環化來製備。此環化係在例如乙醇、乙腈或 N,N-二甲基甲醯胺中，藉由類似例如 WO2005/66177、WO2012/88411、WO2013/3298、US2009/203705、US2012/258951、WO2012/168733、WO2014/187762 或 J. Med. Chem. **31** (1988) 1590-1595 中所述方法之已知方法來進行。

式(IX)之化合物可從市面上購得。

步驟 e)

其中 n 為 0 之式(I)化合物可藉由將式(X)化合物與式(VIa)化合物在鹼的存在下反應，加以製備。式(VIa)之硫醇衍生物，例如甲硫醇、乙硫醇或異丙基硫醇可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 US2006/25633、US2006/111591、US2820062、Chemical Communications, **13** (2000), 1163-1164 或 Journal of the American Chemical Society, **44** (1922), p. 1329 中所述之方法。

步驟 f, g)

其中 n 為 1 之式(I)化合物可藉由將其中 n 為 0 之式(I)化合物氧化來製備。此氧化一般係藉由已知的方法使用適合的氧化劑，例如過氧化氫、間氯過氧苯甲酸或過碘酸鈉來進行。

其中 n 為 2 之式(I)化合物可藉由將其中 n 為 1 之式(I)化合物氧化來製備。

此氧化一般係在溶劑中進行。較佳的係給予鹵化烴類，例如二氯甲烷、

氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯；醇類，例如甲醇或乙醇；甲酸、乙酸、丙酸或水。適合的氧化劑實例有過氧化氫和間-氯過氧苯甲酸。

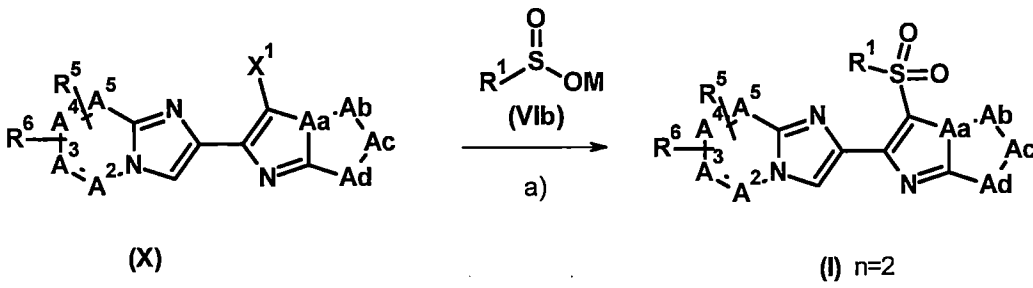
步驟 h)

其中 n 為 2 之式(I)化合物亦可用一步法，藉由將其中 n 為 0 之式(I)化合物氧化來製備。此氧化一般係溶劑中進行。較佳的係給予鹵化烴類，例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯；醇類，例如甲醇或乙醇；甲酸、乙酸、丙酸或水。適合的氧化劑實例有過氧化氫和間-氯過氧苯甲酸。

其中 Q 為 Q10、Q11、Q15 和 Q16 之式(I')化合物可同樣類似方法 B，由式(III')之對應羧酸著手進行，其可能的製備路徑係描述於方法 H、I 和 J 中。

方法 B-2

其中 Q 為 Q10、Q11、Q15 或 Q16 之式(I)化合物可藉由已知的方法來製備，例如類似 US2009/203705、US2012/258951、WO2013/3298 或 J. Med. Chem. **31**, (1988) 1590-1595 中所述之方法。



R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、Aa、Ab、Ac、Ad 基和 n 具有上述之定義， A^2 、 A^3 、 A^4 和 A^5 為 CH 或 N，M 為鋰、鈉或鉀，而 X^1 為鹵素。

步驟 a)

另一種選擇，其中 n 為 2 之式(II)化合物亦可用單階段製程來製備，例如類似 Journal of Organic Chemistry 2005, 70, 2696-2700 中所描述的方法，

藉由鹵素-硼與式(VIb)化合物交換，由式(X)化合物著手進行。此交換一般係在溶劑中進行。較佳的係使用極性非質子溶劑，例如二甲基亞硼和 N,N-二甲基甲醯胺。

式(VIb)化合物可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 Organic Synthesis 1977, 57, 88-92 ; Tetrahedron Letters 1979, 9, 821-824 和 Bulletin de la Societe Chimique de France 1958, 4, 447-450 中所述之方法。

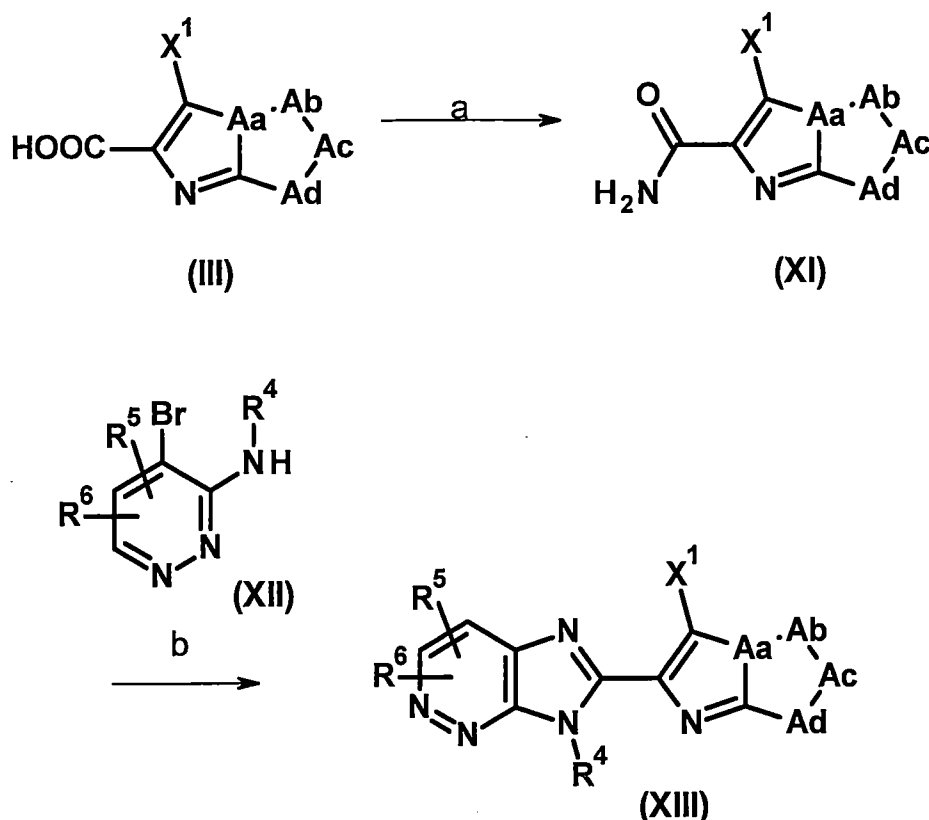
適合的硫試劑之實例有亞磺酸之鋰鹽、鈉鹽或鉀鹽。

反應可在降低的壓力下、標準壓力或升高的壓力下及於-20°C 至 120°C 的溫度下進行。

其中 Q 為 Q10、Q11、Q15 和 Q16 之式(I')化合物可同樣類似方法 B-2 來製備。

方法 C

其中 Q 為 Q17 之式(I)化合物可藉由已知的方法來製備，例如類似 WO2014/142292 中所描述的方法。



R⁴、R⁵、R⁶、Aa、Ab、Ac 和 Ad 基具有上述定義。X¹ 為鹵素。

步驟 a)

式(XI)化合物可用類似 US5374646 或 Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 2003, 13, 1093-1096 中所述的方法，藉由將式(III)化合物與氨來源在縮合劑的存在下反應，加以製備。

式(III)之羧酸可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備。可能的製備路徑係描述於方法 E、F 和 G 中。

式(III)化合物與氨來源之反應較佳地係在選自習用溶劑之溶劑中進行，而該習用溶劑在當時的反應條件下為惰性的。較佳的係給予醚類，例如二噁烷或四氫呋喃。

適合的縮合劑為，例如羰基二咪唑。

反應可在降低的壓力下、標準壓力或升高的壓力下進行。較佳地，此反應係在大氣壓及於 20°C 至 70°C 的溫度下進行。

步驟 b)

式(XIII)化合物可用類似 WO2014/142292 中所述的方法，藉由將式(XI)化合物與式(XII)化合物在鈀催化劑的存在下，於鹼性媒劑中反應，加以製備。

式(XII)化合物可例如類似 WO2014/142292 中所述的方法來製備。所用的鈀催化劑可例如為[1,1'-雙-(二苯基膦基)二茂鐵]二氯鈀(II)。通常，所用的鹼為無機鹼，例如第三丁醇鉀。

反應係在溶劑中進行。通常係使用甲苯。

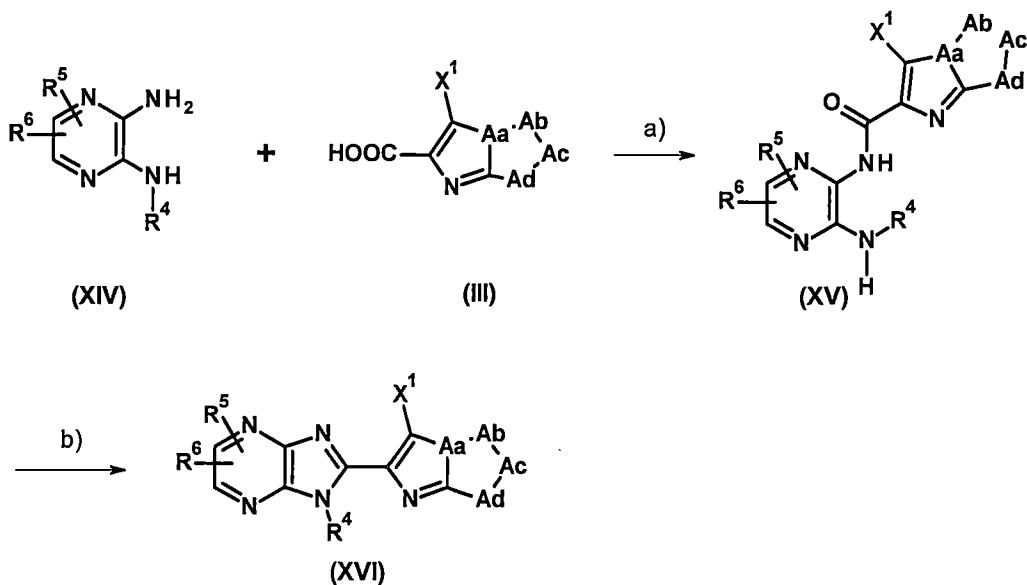
反應可在降低的壓力下、標準壓力或升高的壓力下進行。較佳地，此反應係在大氣壓下及於 20°C 至 110°C 的溫度下進行。

將式(XIII)化合物進一步轉變成式(I)化合物係類似方法 A 來進行。

其中 Q 為 Q17 之式(I')化合物可同樣類似方法 C，由式(III')之對應的羧酸著手進行來製備，其可能的製備路徑係描述於方法 H、I 和 J 中。

方法 D

其中 Q 為 Q14 之式(I)化合物可藉由已知的方法來製備，例如類似 WO2011/073149 中所描述的方法。



R^4 、 R^5 、 R^6 、Aa、Ab、Ac 和 Ad 基係具有上述定義。 X^1 為鹵素。

步驟 a)

式(XV)可用類似 WO2011/073149 或 US5576335 中所描述的方法，藉由將式(XIV)化合物與式(III)之羧酸在縮合劑或鹼的存在下反應，加以製備。

式(XIV)化合物可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 WO2008/51493 中或 *Bioorganic and Medicinal Chemistry* **22** (2014), 3515 – 3526 中所述的方法。

式(III)之羧酸可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備。可能的製備路徑係描述於方法 E、F 和 G 中。

式(XIV)化合物與式(III)之羧酸的反應可不加溶劑或在溶劑中進行，較佳的係在選自習用的溶劑中進行反應，而該習用溶劑在當時的反應條件下為惰性的。較佳的係給予醚類，例如異丙醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧基乙烷；鹵化烴類，例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯；腈類，例如乙腈或丙腈；芳香烴類，例如甲苯或二甲苯；非質子極性溶劑，例如 N,N-二甲基甲醯胺或 N-甲基吡咯酮，或氮化合物，例如吡啶。

適合的縮合劑有，例如碳二亞胺，如 1-(3-二甲基胺基丙基)-3-乙基碳二亞胺鹽酸鹽(EDCI)或 1,3-二環己基碳二亞胺。

適合的鹼為典型用於此等反應中之無機鹼。較佳的係使用例如由鹼金屬或鹼土金屬之乙酸鹽、磷酸鹽、碳酸鹽和碳酸氫鹽組成之群中選出的鹼。特佳的在本處係給予乙酸鈉、磷酸鈉、磷酸鉀、碳酸銨、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鈉、碳酸氫鉀。

反應可在降低的壓力下、標準壓力或升高的壓力下及於 0°C 至 180°C 的溫度下進行；其中較佳的，此反應係在標準壓力及 20 至 140°C 溫度下進行。

步驟 b)

式(XVI)化合物可藉由將式(XV)化合物縮合來製備，例如類似 WO2009/131237、WO2010/125985、WO2011/043404、WO2011/040629、WO2012/086848、WO2013/018928 或 WO2015/000715 中所述之方法。

轉化成式(XVI)化合物可不加溶劑或在溶劑中進行，較佳的係在選自習用的溶劑中進行反應，而該習用溶劑在當時的反應條件下為惰性的。較佳的係給予醚類，例如異丙醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、第三丁基甲基醚；鹵化烴類，例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯；腈類，例如乙腈或丙腈；芳香烴類，例如甲苯或二甲苯；非質子極性溶劑，例如 N,N-二甲基甲醯胺或 N-甲基吡咯酮，或氮化合物，例如吡啶。

反應可在縮合劑、酸、鹼或氯化劑的存在下進行。

適合的縮合劑實例有碳二亞胺，例如 1-(3-二甲基胺基丙基)-3-乙基碳二亞胺鹽酸鹽(EDCI)或 1,3-二環己基碳二亞胺；酸酐，例如乙酸酐、三氟乙酸酐；三苯基磷、鹼和四氯化碳之混合物，或三苯基磷和偶氮二酯，例如偶氮二甲酸二乙酯之混合物。

可用於所述反應中之適合的酸之實例有磺酸，例如對甲苯磺酸；羧酸，例如乙酸或多磷酸。

適合的鹼之實例有氮雜環類，例如吡啶、甲基吡啶、2,6-二甲基吡啶、1,8-二氮雜雙環[5.4.0]-7-十一烯(DBU)；三級胺，例如三乙胺和 N,N-二異丙基乙基胺；無機鹼，例如磷酸鉀、碳酸鉀和氫化鈉。

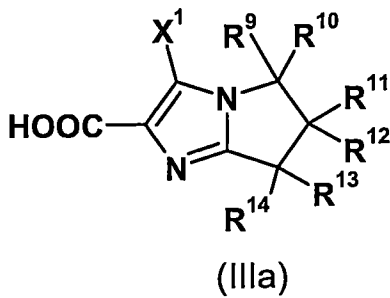
適合的氯化劑之實例為氧氯化磷。

此反應可在降低的壓力下、標準壓力或升高的壓力下及於 0°C 至 200°C 的溫度下進行。

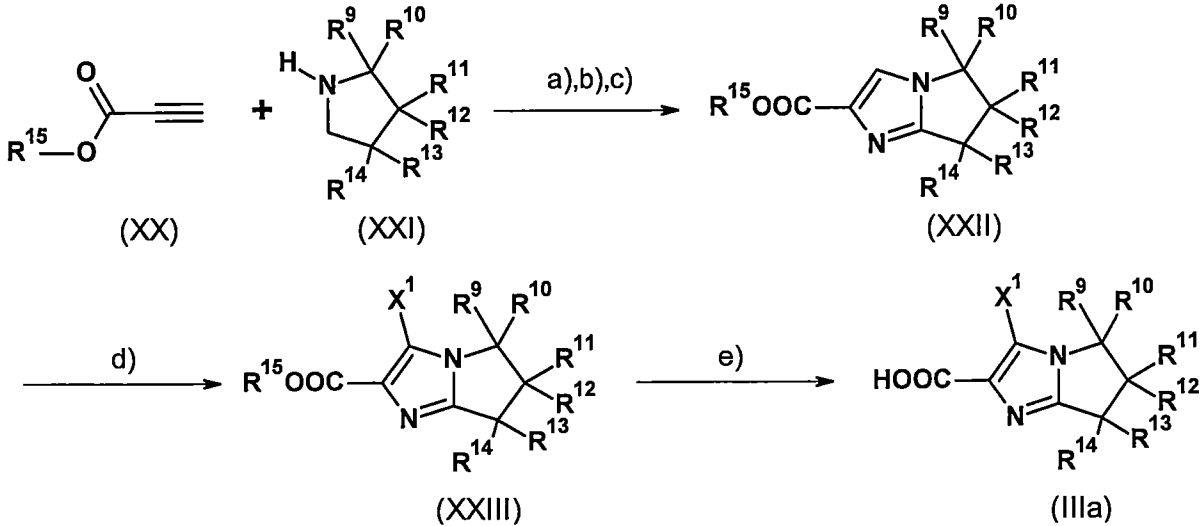
將式(XVI)化合物進一步轉化為式(I)化合物係類似方法 A 來進行。

其中 Q 為 Q14 之式(I')化合物可同樣類似方法 D，由式(III')之對應的羧酸著手進行來製備，就其可能的製備路徑係描述於方法 H、I 和 J 中。

方法 E



帶有結構單元 A1 之式(IIIa)羧酸可從市面上購得或可藉由已知的方法，例如由吡咯啉衍生物類似 WO2011/098904；Chemical Communications, **48** (2012), 3133-3135；Organic Letters, **6** (2004), 3525-3528；Journal of Organic Chemistry, **73** (2008), 312-315；Journal of the American Chemical Society, **131** (2009), 1766-1774；Journal of the American Chemical Society, **135** (2013), 9588-9591；Journal of the American Chemical Society, **133** (2011), 12394-12397；Journal of the American Chemical Society, **130**, (2008), 1570-1571 和 Organic Letters, **8** (2006), 5303-5305 中所述的方法來製備。



R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 和 R^{14} 基係具有上述定義。 X^1 為鹵素，而 R^{15} 為(C₁-C₆)烷基或芳基(C₁-C₂)烷基。

步驟 a), b), c)

式(XXII)化合物可用類似 *Chemical Communications*, **48** (2012), 3133-3135 和 WO2011/098904 中所描述的方法來製備，藉由將式(XXI)化合物與式(XX)之丙炔酸在中性條件下以麥可加成反應，接著藉由在麥可加合物的 α -碳原子上使用典型的重氮化試劑加以重氮化及隨後於鹼性條件下環化，得到所欲的 6,7-二氫-5H-吡咯并[1,2-a]咪唑。

式(XXI)化合物可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 *Organic Letters*, **6** (2004), 3525-3528 ; *Journal of Organic Chemistry*, **73** (2008), 312-315 ; *Journal of the American Chemical Society*, **131** (2009), 1766-1774 ; *Journal of the American Chemical Society*, **135** (2013), 9588-9591 ; *Journal of the American Chemical Society*, **133** (2011), 12394-12397 ; *Journal of the American Chemical Society*, **130**, (2008), 1570-1571 和 *Organic Letters*, **8** (2006), 5303-5305 中所述的方法。

式(XX)化合物可從市面上購得。

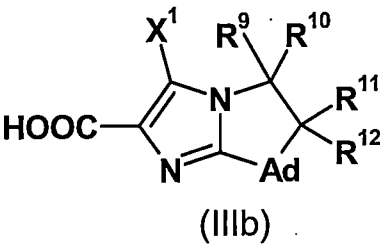
步驟 d)

式(XXIII)化合物可藉由已知的方法，例如經由定向鄰位鋰化，接著以適合的親電子鹵化劑捕捉負碳離子，或另一種選擇以類似 *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, **24** (2014), 4236-4238; *Tetrahedron*, **58** (2002), 6723-6728 and WO2003/010146 中所述的方法，經由羧酸衍生物-定向鹵化作用來製備。

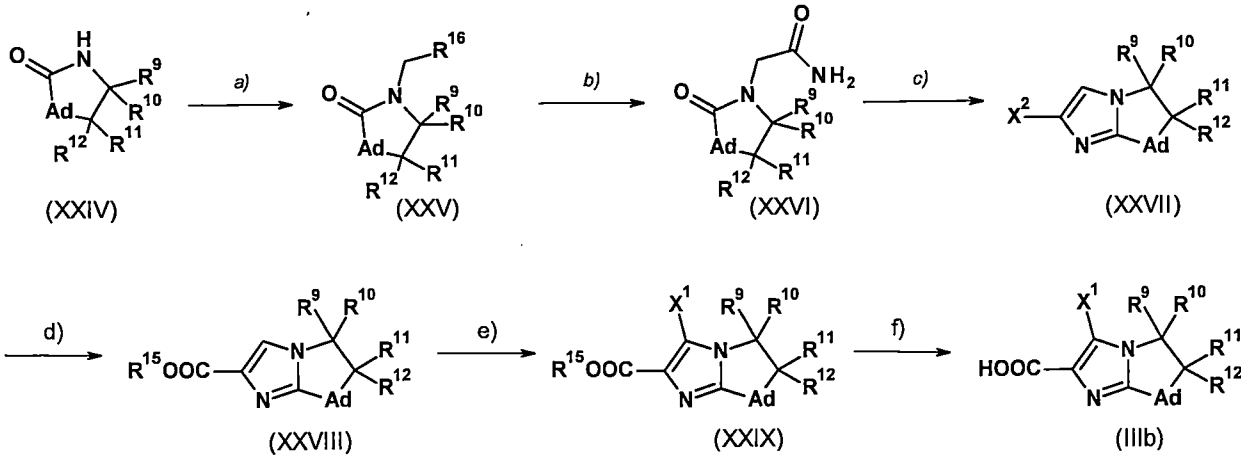
步驟 e)

式(IIIa)化合物可藉由已知的方法，從式(XXIII)化合物於酸性、鹼性、熱或氫解條件下經由酯水解來製備。

方法 F



帶有結構單元 A2、A3 或 A4 的式(IIIb)之羧酸可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如由嘔唑啉酮、噻唑啉酮或咪唑啉酮衍生物，類似 Russian Journal of Organic Chemistry, **46** (2010), 1461-1465 ; US2005/0256164 ; US2002/0098443 ; Chemical Biology & Drug Design, **85** (2015), 454-460 ; Synthetic Communications, **45** (2015), 1183-1189 ; Journal of the American Chemical Society, **137** (2015), 6440-6443 ; Journal of Medicinal Chemistry, **58** (2015), 3892-3909 ; Helvetica Chimica Acta, **33** (1950), 1776-1787 ; Journal of the American Chemical Society, **73** (1951), 4199-4204 ; Molecules, **19** (2014), 14-18 ; Chemical Communications, **50** (2014), 9661-9664 ; Green Chemistry, **15** (2013), 2447-2456 ; WO2009/135927 ; Khimiko-Farmatsevticheskii Zhurnal, **18** (1984), 290-297 ; Journal of the American Chemical Society, **135** (2013), 2891-2894 ; Synlett, **11** (2006), 1663-1666 ; Helvetica Chimica Acta, **55** (1972), 2295-2300 ; WO2013/149997 及 European Journal of Organic Chemistry, **29** (2014), 6418-6430 中所述的方法。



R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 和 R^{12} 基具有上述定義。Ad 為 $-S(O)_m-$ 、 $-O-$ 或 $-N(R^7)-$ 。
 X^1 和 X^2 為鹵素， R^{15} 為 (C_1-C_4) 烷基或芳基 (C_1-C_2) 烷基而 R^{16} 為 $-CN$ 或 $-COOR^{17}$ ，其中 R^{17} 為 (C_1-C_4) 烷基。

步驟 a)

式(XXV)化合物可用類似 Russian Journal of Organic Chemistry, **46** (2010), 1461-1465；US2005/0256164 和 US2002/0098443 中所述的方法，經由式(XXIV)之嘮唑啉酮、噻唑啉酮或咪唑啉酮衍生物與適當的烷基 α -鹵基-或 α -二氮雜羧酸酯或-腈於酸性或鹼性條件下烷化來合成。

式(XXIV)化合物可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 Chemical Biology & Drug Design, **85** (2015), 454-460；Synthetic Communications, **45** (2015), 1183-1189；Journal of the American Chemical Society, **137** (2015), 6440-6443；Journal of Medicinal Chemistry, **58** (2015), 3892-3909；Helvetica Chimica Acta, **33** (1950), 1776-1787 及 Journal of the American Chemical Society, **73** (1951), 4199-4204 中所述的方法。

步驟 b)

式(XXVI)化合物可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如經由胺解，其中 R^{16} 為 $-CN$ ，或經由醯胺化，其中 R^{16} 為 $-COOR^{17}$ ，由式(XXV)化合物，類似 Molecules, **19** (2014), 14-18；Chemical Communications, **50** (2014), 9661-9664 及 Green Chemistry, **15** (2013), 2447-2456 中所述的方法，著手進行。

步驟 c)

式(XXVII)化合物可從市面上購得或可藉由已知的方法從式(XXVI)化合物經由分子內縮合來製備。此項可，例如使用氧氯化磷於熱條件下以類似 WO2009/135927 和 Khimiko-Farmatsevticheskii Zhurnal, **18** (1984),

290-297 中所述的方法來進行。

步驟 d)

式(XXVIII)化合物可從市面上購得或可經由羰化作用藉由已知的方法從式(XXVII)化合物，類似 *Journal of the American Chemical Society*, **135** (2013), 2891-2894; *Synlett*, **11** (2006), 1663-1666; *Helvetica Chimica Acta*, **55** (1972), 2295-2300 ; WO2013/149997 和 *European Journal of Organic Chemistry*, **29** (2014), 6418-6430 中所述的方法來合成。

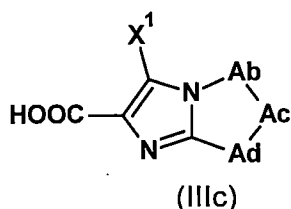
步驟 e)

式(XXIX)之羧酸酯衍生物可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如經由鹵化作用。此項可例如，經由定向鄰位鋰化，接著以適合的親電子鹵化劑捕捉負碳離子，或另一種選擇經由羧酸衍生物-定向鹵化作用，以類似 *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, **24** (2014), 4236-4238; *Tetrahedron*, **58** (2002), 6723-6728 和 WO2003/010146 中所述的方法來進行。

步驟 f)

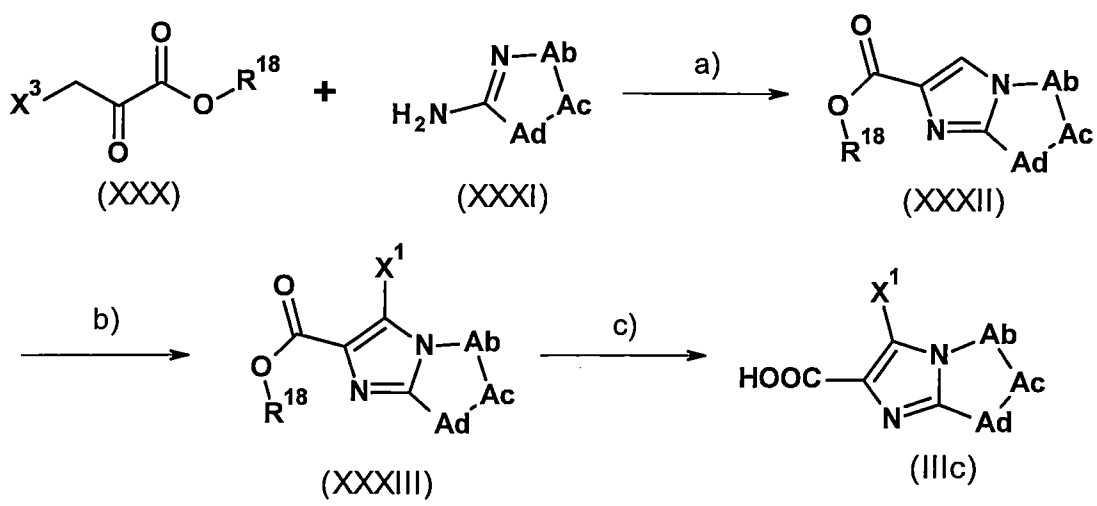
式(IIIb)化合物可藉由已知的方法從式(XXIX)化合物，經由酯水解於酸性、鹼性、熱或氫解條件下來製備。

方法 G



帶有結構單元 A5、A6、A7、A8、A9、A10、A11、A12 或 A13 的式(IIIc)之羧酸可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 WO2013/163244 ; *Farmaco, Edizione Scientifica*, **40** (1985), 190-199 ;

WO2013/087792 ; Journal of Medicinal Chemistry, **46** (2003), 3914-3929 ;
WO2015/011082 ; Journal of Medicinal Chemistry, **58** (2015), 8309-8313 ;
Advanced Synthesis & Catalysis, **357** (2015), 1065-1069 ; Bioorganic
Chemistry, **59** (2015), 151-167 ; Journal of the Chemical Society, (1929),
815-816 ; Organic Syntheses, **19** (1939), 10-11 ; Journal of the American
Chemical Society, **63** (1941), 2946-2948 ; Helvetica Chimica Acta, **32** (1949),
35-38 ; Journal of Organic Chemistry, **15** (1950), 1082-1092 ; Journal of the
American Chemical Society, **73** (1951), 3300-3304 ; Bioorganic & Medicinal
Chemistry Letters, **24** (2014), 4236-4238 ; Tetrahedron, **58** (2002), 6723-6728
和 WO2003/010146 中所述之方法。



Ab 為=N-或=C(R²)-, Ac 為=N-或=C(R³)-而 Ad 為=N-、-N(R⁷)-、-O-
或-S(O)_m-。X¹ 和 X³ 獨立地為鹵素。R¹⁸ 為(C₁-C₄)烷基。

步驟 a)

式(XXXII)化合物可經由式(XXXI)之 2-氨基雜芳基衍生物與式(XXX)
之 α -鹵基丙酮酸酯的縮合,例如以類似 WO2013/163244;Farmaco, Edizione
Scientifica, **40** (1985), 190-199 ; WO2013/087792 ; Journal of Medicinal
Chemistry, **46** (2003), 3914-3929 和 WO2015/011082 中所述的方法來合
成。

式(XXXI)化合物可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 Journal of Medicinal Chemistry, **58** (2015), 8309-8313 ; Advanced Synthesis & Catalysis, **357** (2015), 1065-1069 ; Bioorganic Chemistry, **59** (2015), 151-167 ; Journal of the Chemical Society, (1929), 815-816 ; Organic Syntheses, **19** (1939), 10-11 ; Journal of the American Chemical Society, **63** (1941), 2946-2948 ; Helvetica Chimica Acta, **32** (1949), 35-38 ; Journal of Organic Chemistry, **15** (1950), 1082-1092 和 Journal of the American Chemical Society, **73** (1951), 3300-3304 中所述的方法。

式(XXX)化合物可從市面上購得。

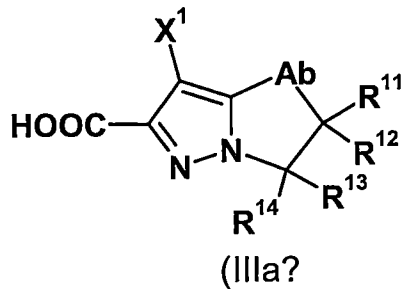
步驟 b)

式(XXXIII)化合物可藉由已知的方法，例如經由定向鄰位鋰化，接著以適合的親電子鹵化劑捕捉負碳離子，或另一種選擇，經由羧酸衍生物-定向鹵化作用以類似 Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, **24** (2014), 4236-4238 ; Tetrahedron, **58** (2002), 6723-6728 和 WO2003/010146 中所述的方法來製備。

步驟 c)

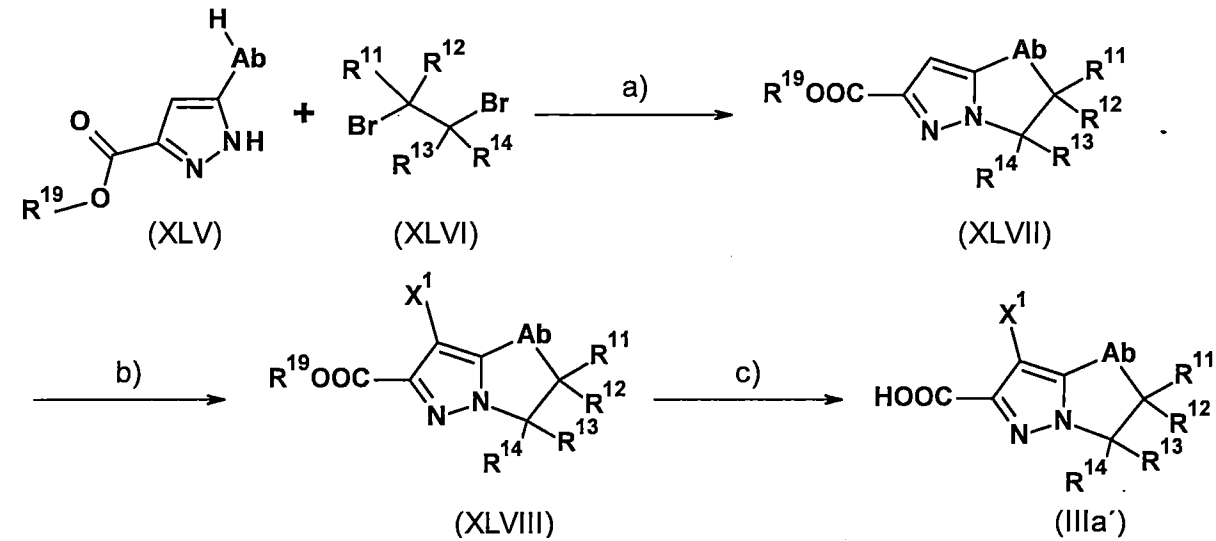
式(IIIc)化合物可藉由已知的方法，從式(XXIII)化合物於酸性、鹼性、熱或氫解條件下經由酯水解來製備。

方法 H



帶有結構單元 A15 或 A17 的式(IIIa')之羧酸可從市面上購得或可藉由

已知的方法來製備，例如類似 WO2006/130588；Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, **24** (2014), 4236-4238；Tetrahedron, **58** (2002), 6723-6728 和 WO2003/010146 中所述的方法。



R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 和 R^{14} 基具有上述之定義。Ab 為 $-N(R^7)-$ 、 $-O-$ 或 $-S-$ 。
 X^1 為鹵素， R^{19} 為 (C_1-C_4) 烷基或芳基 (C_1-C_2) 烷基。

步驟 a)

式(XLVII)化合物可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 WO2006/130588 中所述的方法，藉由將式(XLV)之胺基吡唑基或經基吡唑基衍生物與式(XLVI)之 1,2-二溴乙烷衍生物，使用鹼和熱條件雙烷基化。

式(XLV)化合物可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 Bioorganic & Medicinal Chemistry, **20** (2012), 714-733；WO2010/127975；Journal of Medicinal Chemistry, **50** (2007), 5161-5167；Journal of Combinatorial Chemistry, **7** (2005), 236-245；WO2010/096115 和 WO2004/074257 中所述的方法。

式(XLVI)化合物可從市面上購得或可經由對應的烯烴化合物之二溴化，經由 Journal of Organic Chemistry, **65** (2000), 2379-2385；Tetrahedron:

Asymmetry, **16** (2005), 2973-2979 ; Chemische Berichte, **111** (1987), 411-414 及 Indian Journal of Chemistry, Section B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry, **208** (1981), 617-619 中所述的方法來製備。

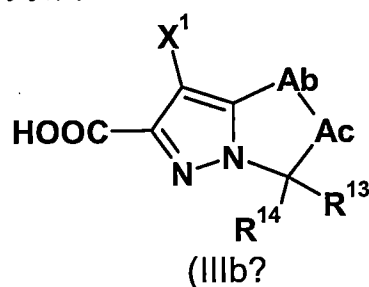
步驟 b)

式(XLVIII)化合物可從市面上購得或可經由式(XLVII)化合物之鹵化作用來製備。此項可例如，經由定向鄰位鋰化，接著以適合的親電子鹵化劑捕捉負碳離子，或另一種選擇經由羧酸衍生物-定向鹵化作用，以類似 Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, **24** (2014), 4236-4238 ; Tetrahedron, **58** (2002), 6723-6728 和 WO2003/010146 中所述的方法來進行。

步驟 c)

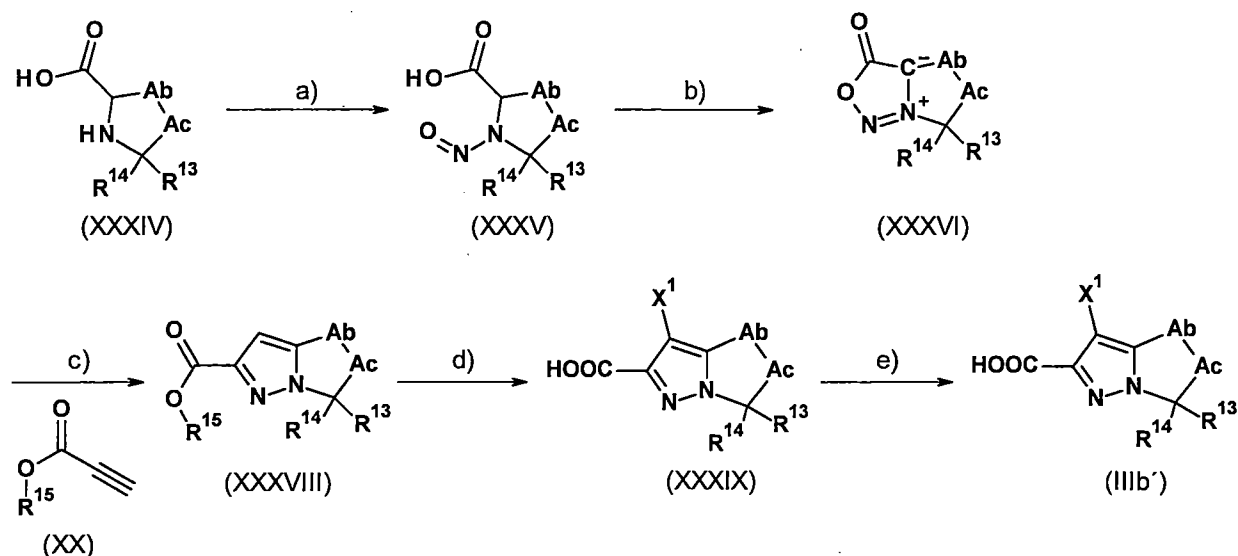
式(IIIa')化合物可藉由已知的方法，從式(XLVIII)化合物經由酸性、鹼性、熱或氫解條件下之酯水解來製備。

方法 I



帶有結構單元 A14、A16 或 A18 之式(IIIb')之羧酸可從市面上購得或可經由已知的方法來製備，例如以類似 Organic Process Research & Development, **10** (2006), 712-716 ; WO2006/130588 ; WO2010/117425 ; Journal of the American Chemical Society, **71** (1949), 2818-2820 ; Journal of Biological Chemistry, **198** (1952), 587-597 ; Bulletin of the Chemical Society of Japan, **36** (1963), 25-29 ; Italian Journal of Biochemistry, **28** (1979),

104-110; Chemical & Pharmaceutical Bulletin, **30** (1982), 440-461; Chemistry Letters, **7** (1985), 939-942; Tetrahedron Letters, **24** (1983), 1067-1070; Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, **24** (2014), 4236-4238; Tetrahedron, **58** (2002), 6723-6728 和 WO2003/010146 中所述的方法。



R^{13} 和 R^{14} 基係具有上述之定義。 R^{15} 為 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷基或芳基 $(\text{C}_1\text{-C}_2)$ 烷基。
 Ab 為 $-\text{C}(\text{R}^9)(\text{R}^{10})-$ 、 $-\text{S}(\text{O})_m-$ 、 $-\text{O}-$ 或 $-\text{N}(\text{R}^7)-$ 。 Ac 為 $-\text{C}(\text{R}^{11})(\text{R}^{12})-$ 、 $-\text{S}(\text{O})_m-$ 、 $-\text{O}-$ 或 $-\text{N}(\text{R}^7)-$ 。 X^1 為鹵素。

步驟 a)

式(XXXV)之亞硝基脯胺酸衍生物可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 Organic Process Research & Development, **10** (2006), 712-716; WO2006/130588 和 WO2010/117425 中所述的方法，經由式(XXXIV)化合物之亞硝化作用。

通式(XXXIV)化合物可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 Journal of the American Chemical Society, **71** (1949), 2818-2820; Journal of Biological Chemistry, **198** (1952), 587-597; Bulletin of the Chemical Society of Japan, **36** (1963), 25-29; Italian Journal of Biochemistry, **28** (1979), 104-110; Chemical & Pharmaceutical Bulletin, **30** (1982), 440-461

及 Chemistry Letters, **7** (1985), 939-942 中所述的方法。

步驟 b)

式(XXXVI)之介離子雪梨酮(mesoionic sydnone)衍生物可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 Organic Process Research & Development, **10** (2006), 712-716；WO2006/130588 和 WO2010/117425 中所述的方法，從式(XXXV)化合物藉由使用，例如三氟乙酸酐作為脫水劑之雜環化。

步驟 c)

通式(XXXVIII)化合物可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 Organic Process Research & Development, **10** (2006), 712-716, WO2006/130588；Tetrahedron Letters, **24** (1983), 1067-1070 和 WO2010/117425 中所述的方法，經由式(XX)化合物和式(XXXVII)之丙酸乙酯的 1,3-偶極環加成及隨後反加成合環作用釋放 CO₂。

式(XX)化合物可從市面上購得。

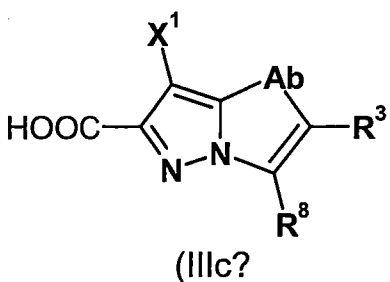
步驟 d)

式(XXXIX)化合物可從市面上購得或可藉由已知的方法，經由式(XXVIII)化合物之鹵化作用來製備。此項可例如，經由定向鄰位鋰化，接著以適合的親電子鹵化劑捕捉負碳離子，或另一種選擇經由羧酸衍生物-定向鹵化作用，以類似 Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, **24** (2014), 4236-4238；Tetrahedron, **58** (2002), 6723-6728 和 WO2003/010146 中所述的方法來進行。

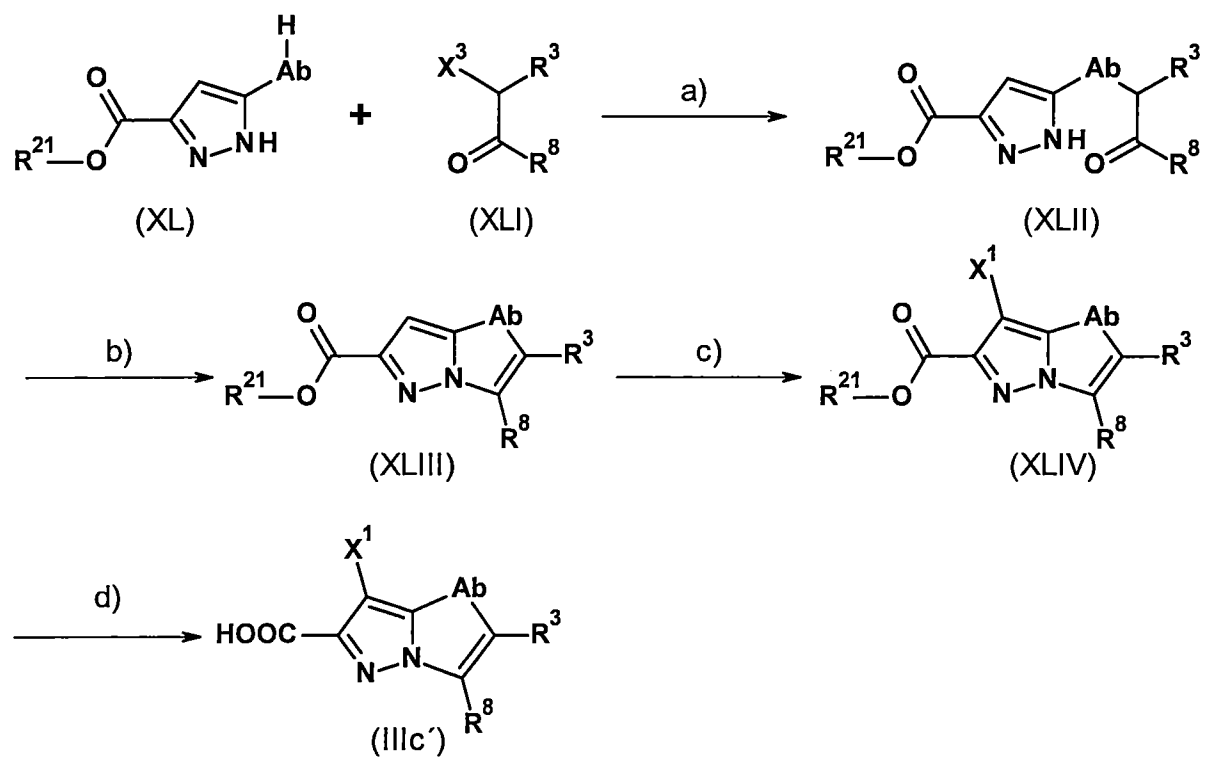
步驟 e)

式(IIIb')化合物可藉由已知的方法，從式(XXXIX)化合物經由酸性、鹼性、熱或氫解條件下之酯水解來製備。

方法 J



帶有結構單元 A19 或 A20 的式(IIIc')之羧酸可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 Bioorganic & Medicinal Chemistry, **16** (2008), 1890-1902 ； WO2003/093280 ； WO2001/016138 ； WO2008/067257 ； WO2011/079230 ； WO2008/015271 ； WO2004/092140 ； Russian Chemical Bulletin, **59** (2010), 1631-1638 ； Journal of Combinatorial Chemistry, **7** (2005), 236-245 ； Journal of the Chemical Society, Perkin Transaction 1: Organic and Bio-Organic Chemistry, **18** (1999), 2639-2644 ； WO2003/035644 ； WO2013/050437 ； European Journal of Medicinal Chemistry, **84** (2014), 718-730, Chemistry – A European Journal, **18** (2012), 14943-14947 及 WO2013/036994 中所述的方法。



R^3 和 R^8 基係具有上述之定義。Ab 為 $-S(O)_m-$ 、 $-O-$ 或 $-N(R^7)-$ 。 X^1 和 X^3 為鹵素而 R^{21} 為 (C_1-C_4) 烷基或芳基 (C_1-C_2) 烷基。

步驟 a)

通式(XLII)化合物可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 Bioorganic & Medicinal Chemistry, **16** (2008), 1890-1902；WO2003/093280；WO2001/016138 和 WO2008/067257 中所述的方法，經由 5-胺基吡唑(Ab 為 $-N(R^7)-$)、5-巰基吡唑(Ab 為 $-S-$)或 5-羥基吡唑衍生物(Ab 為 $-O-$)與式(XLI)之 α -鹵基酮的烷化作用。

式(XL)化合物可從市面上購得或可藉由已知的方法來製備，例如類似 WO2011/079230；WO2008/015271；WO2004/092140；Russian Chemical Bulletin, **59** (2010), 1631-1638；Journal of Combinatorial Chemistry, **7** (2005), 236-245；Journal of the Chemical Society, Perkin Transaction 1: Organic and Bio-Organic Chemistry, **18** (1999), 2639-2644 和 WO2003/035644 中所述的方法。

式(XLI)化合物可從市面上購得或可經由 Journal of the American Chemical Society, **132** (2010), 1264-1266；Organic Preparations and Procedures International, **7** (1975), 149-154 及 European Journal of Medicinal Chemistry, **16** (1981), 495-501 中所述的方法，經由對應酮類之 α -鹵素化作用來製備。

步驟 b)

通式(XLIII)化合物可從市面上購得或可藉由已知的方法，例如類似 WO2013/050437；European Journal of Medicinal Chemistry, **84** (2014), 718-730；Chemistry – A European Journal, **18** (2012), 14943-14947 和 WO2013/036994 中所述的方法，經由式(XLII)化合物之分子內縮合來製

備。

步驟 c)

式(XLIV)化合物可從市面上購得或可藉由已知的方法，經由鹵化作用來製備。此項可例如，經由定向鄰位鋸化，接著以適合的親電子鹵化劑捕捉負碳離子，或另一種選擇經由羧酸衍生物-定向鹵化作用，以類似 Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, **24** (2014), 4236-4238 ; Tetrahedron, **58** (2002), 6723-6728 和 WO2003/010146 中所述的方法來進行。

步驟 d)

式(IIIc')化合物可藉由已知的方法，從式(XLIV)化合物經由酸性、鹼性、熱或氫解條件下之酯水解來製備。

方法和用途

本發明亦關於防治動物害蟲之方法，其中式(I)或式(I')化合物能作用在動物害蟲及/或其棲息地上。動物害蟲之防治較佳地係用於農業和林業以及材料保護上。較佳地，由此係排除用於人類或動物體之手術或治療之方法以及在人類或動物體所進行的診斷方法。

本發明進一步係關於式(I)或式(I')化合物作為除害劑，特別是作物保護劑之用途。

在本申請書之內容中，術語「除害劑」在各情況下通常亦涵蓋術語「作物保護劑」。

式(I)或式(I')化合物，具有良好的植物耐受性、有利的恆溫動物毒性及良好的環境相容性，係適合用於保護植物和植物器官對抗生物和非生物性脅迫，供增加收穫量、改善收穫物之品質及供防治動物害蟲，特別是農業上、園藝上、畜牧業上、水產養殖上、林業上、花園和休閒設施上、儲存

產品和材料保護上及衛生部分會遭遇到的昆蟲、蜘蛛類、蠕蟲，特別是線蟲和軟體動物。

在本專利申請書之內容中，術語「衛生」應了解係指任何及所有具有防止疾病，特別是感染疾病之目標，及係用於保護人類和動物健康及/或保護環境及/或維護清潔之措施、防備和程序。根據本發明，此項特別是包括用於清潔、消毒、殺菌之方法，例如紡織品或硬實表面，特別是玻璃、木材、水泥、瓷器、陶器、塑膠或其他金屬之表面，以確保這些無衛生害蟲及/或其分泌物。就此，本發明的保護範圍較佳地係排除應用人體或動物體之手術或治療性處理程序，以及在人類或動物體所進行的診斷程序。

術語「衛生部分」係涵蓋所有區域、技術領域和工業應用，其中這些衛生措施、防備和程序，例如就廚房、烘培屋、機場、浴室、游泳池、百貨公司、旅館、醫院、畜欄、動物養育等方面而言為重要的。

術語「衛生害蟲」因此應了解係指出現在衛生部門之一或多種動物害蟲，其特別是就健康因素係構成問題的。因此主要的目標為避免或將衛生部分中衛生害蟲的存在及/或其暴露限制至最小程度。此項特別可經由使用可用於防止侵擾和防止現有侵擾二者之除害劑來達成。亦可能使用防止或降低暴露於害蟲中的調配物。衛生害蟲包括，例如下文所提之生物。

術語「衛生保護」因此係涵蓋所有藉此維持及/或增進這些衛生措施、防備和程序之作為。

式(I)或式(I')化合物較佳地可用作除害劑。其一般可有效對抗敏感性和抗藥性物種且亦對抗所有或特定發育期別。上文所提及的害蟲包括：

來自節肢動物門之害蟲，特別是來自蜘蛛綱，例如粉蟎屬(*Acarus* spp.)，例如粉塵蟎(*Acarus siro*)、枸杞瘧節蟎(*Aceria kuko*)、柑橘瘧瘧蟎(*Aceria sheldoni*)、刺皮節蟎屬(*Aculops* spp.)、刺瘧蟎屬(*Aculus* spp.)，例如李刺蟎

蟎(*Aculus fockeui*)、蘋果銹蟎(*Aculus schlechtendali*)、花蟎屬(*Amblyomma* spp.)、山楂葉蟎(*Amphitetranychus viennensis*)、銳緣蟎屬(*Argas* spp.)、牛蟎屬(*Boophilus* spp.)、短須蟎屬(*Brevipalpus* spp.)，例如紫紅短鬚蟎(*Brevipalpus phoenicis*)、禾穀苔蟎(*Bryobia graminum*)、苜蓿苔蟎(*Bryobia praetiosa*)、刺尾蠍屬(*Centruroides* spp.)、皮蟎屬(*Choriotptes* spp.)、雞刺皮蟎(*Dermanyssus gallinae*)、塵蟎(*Dermatophagoides pteronyssinus*)、美洲塵蟎(*Dermatophagoides farinae*)、革蟎(*Dermacentor* spp.)、始葉蟎屬(*Eotetranychus* spp.)，例如核桃始葉蟎(*Eotetranychus hicoriae*)、梨上瘦蟎(*Epitrimerus pyri*)、真葉蟎屬(*Eutetranychus* spp.)，例如班氏真葉蟎(*Eutetranychus banksi*)、瘦蟎屬(*Eriophyes* spp.)，例如梨瘦蟎(*Eriophyes pyri*)、家食甜蟎(*Glycyphagus domesticus*)、紅足海德蝨蟎(*Halotydeus destructor*)、半跑線蟎屬(*Hemitarsonemus* spp.)，例如茶塵蟎(*Hemitarsonemus latus*)(=*Polyphagotarsonemus latus*)、璃眼蟎屬(*Hyalomma* spp.)、硬蟎屬(*Ixodes* spp.)、寡婦蛛屬(*Latrodectus* spp.)、斜蛛屬(*Loxosceles* spp.)、*Neutrombicula autumnalis*、*Nuphessa* spp.、葉蟎(*Oligonychus* spp.)，例如，例如茶葉蟎(*Oligonychus coffeae*)、*Oligonychus coniferarum*、冬青小爪蟎(*Oligonychus ilicis*)、甘蔗小爪蟎(*Oligonychus indicus*)、芒果小爪蟎(*Oligonychus mangiferus*)、草地小爪蟎(*Oligonychus pratensis*)、鱷梨褐小爪蟎(*Oligonychus punicae*)、樟小爪蟎(*Oligonychus yothersi*)、鈍緣蟎(*Ornithodoros* spp.)、禽刺蟎屬(*Ornithonyssus* spp.)、全爪蟎(*Panonychus* spp.)，例如柑桔全爪蟎(*Panonychus citri*)(=*Metatetranychus citri*)、榆全爪蟎(*Panonychus ulmi*)(=*Metatetranychus ulmi*)、柑桔銹蟎(*Phyllocoptruta oleivora*)、*Platytetranychus multidigituli*、茶黃蟎(*Polyphagotarsonemus latus*)、癢蟎(*Psoroptes* spp.)、扇頭蟎(*Rhipicephalus* spp.)、根蟎(*Rhizoglyphus* spp.)、

疥蟎(*Sarcoptes* spp.)、中東金蠍(*Scorpio maurus*)、細蟎(*Stenotarsonemus* spp.)、稻細蟎(*Steneotarsonemus spinki*)、跗線蟎(*Tarsonemus* spp.)，例如亂跗線蟎(*Tarsonemus confusus*)、白跗線蟎(*Tarsonemus pallidus*)，葉蟎(*Tetranychus* spp.)，例如加拿大葉蟎(*Tetranychus canadensis*)、赤葉蟎(*Tetranychus cinnabarinus*)、土耳其斯坦葉蟎(*Tetranychus turkestanii*)、二點葉蟎(*Tetranychus urticae*)，阿氏真恙蟎(*Trombicula alfreddugesi*)、蠍屬(*Vaejovis* spp.)、番茄斜背瘤節蟬(*Vasates lycopersici*)；

來自唇足目(*Chilopoda*)，例如，土棲屬(*Geophilus* spp.)，蚰蜒(*Scutigera* spp.)；

來自(*Collembola*)彈尾目或綱：例如，棘跳蟲(*Onychiurus armatus*)；綠圓跳蟲(*Sminthurus viridis*)；

來自倍足綱(*Diplopoda*)：例如，節足蟲(*Blaniulus guttulatus*)；

來自昆蟲綱(*Insecta*)，例如來自蜚蠊目(*Blattodea*)，例如東方蟑螂(*Blatta orientalis*)、亞洲蟑螂(*Blattella asahinai*)、德國蟑螂(*Blattella germanica*)、馬得拉蜚蠊(*Leucophaea maderae*)、姬蜚蠊(*Loboptera decipiens*)、家屋斑蠊(*Neostylopyga rhombifolia*)、古巴蜚蠊屬(*Panchlora* spp.)、帕科蜚蠊屬(*Parcoblatta* spp.)、大蠊屬(*Periplaneta* spp.)，例如美洲蜚蠊(*Periplaneta americana*)、澳洲家蠊(*Periplaneta australasiae*)、蘇里南潛蠊(*Pycnoscelus surinamensis*)、長鬚帶蠊(*Supella longipalpa*)；

來自鞘翅目(*Coleoptera*)，例如條紋葉甲(*Acalymma vittatum*)、菜豆象(*Acanthoscelides obtectus*)、金龜(*Adoretus* spp.)、甲蟲(*Agelastica alni*)、叩甲(*Agriotes* spp.)，例如直條叩頭蟲(*Agriotes linneatus*)、小麥金針蟲(*Agriotes mancus*)，外米擬步行蟲(*Alphitobius diaperinus*)、馬鈴薯金龜(*Amphimallon solstitialis*)、傢俱竊蟲(*Anobium punctatum*)、星天牛

(*Anoplophora* spp.)、象甲(*Anthonomus* spp.)，例如棉鈴象甲(*Anthonomus grandis*)，皮蠹(*Anthrenus* spp.)、梨象屬(*Apion* spp.)、甘蔗金龜(*Apogonia* spp.)、微點蟲(*Atomaria* spp.)，例如甜菜隱食甲(*Atomaria linearis*)，黑皮蠹(*Attagenus* spp.)、*Baris caerulescens*、菜豆象(*Bruchidius obtectus*)、象甲(*Bruchus* spp.)，例如豌豆象(*Bruchus pisorum*)、蠶豆象(*Bruchus rufimanus*)，龜金花蟲(*Cassida* spp.)、豆葉甲(*Cerotoma trifurcata*)、莖象甲(*Ceutorrhynchus* spp.)，例如甘藍莖象甲(*Ceutorrhynchus assimilis*)、油菜莖象甲(*Ceutorrhynchus quadridens*)、蕪菁莖象甲(*Ceutorrhynchus rapae*)，跳甲屬(*Chaetocnema* spp.)，例如甘薯金花蟲(*Chaetocnema confinis*)、玉米齒葉甲(*Chaetocnema denticulata*)、*Chaetocnema ectypa*，象甲(*Cleonus mendicus*)、叩甲(*Conoderus* spp.)、象甲(*Cosmopolites* spp.)，例如香蕉球莖象鼻蟲(*Cosmopolites sordidus*)，紐西蘭蟬螯(*Costelytra zealandica*)、叩甲屬(*Ctenicera* spp.)、象甲(*Curculio* spp.)，例如美核桃象甲(*Curculio caryae*)、大栗象甲(*Curculio caryatipes*)、鈍象甲(*Curculio obtusus*)、賽氏象甲(*Curculio sayi*)，角胸粉扁蟲(*Cryptolestes ferrugineus*)、角胸粉扁蟲(*Cryptolestes pusillus*)、楊乾象(*Cryptorhynchus lapathi*)、檬果象鼻蟲(*Cryptorhynchus mangiferae*)、細枝象屬(*Cylindrocopturus* spp.)、密點細枝象(*Cylindrocopturus adspersus*)、黃杉枝象甲(*Cylindrocopturus furnissi*)、蠹(*Dermestes* spp.)、葉甲(*Diabrotica* spp.)，例如巴西玉米根蟲(*Diabrotica balteata*)、北方玉米根蟲(*Diabrotica barberi*)、黃瓜十一星葉甲食根蟲亞種(*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、玉米根螟(*Diabrotica undecimpunctata*)、西部玉米根蟲(*Diabrotica virgifera virgifera*)、墨西哥玉米根蟲(*Diabrotica virgifera zea*)，蛀野螟屬(*Dichocrocis* spp.)、稻鐵甲蟲(*Dicladispa armigera*)、*Diloboderus* spp.、象甲(*Epicaerus* spp.)、瓢蟲

(*Epilachna* spp.)，例如南瓜瓢蟲(*Epilachna borealis*)、墨西哥豆瓢蟲(*Epilachna varivestis*)，毛跳甲屬(*Epitrix* spp.)，例如黃瓜跳甲(*Epitrix cucumeris*)、茄跳甲(*Epitrix fuscula*)、煙草跳甲(*Epitrix hirtipennis*)、美洲馬鈴薯跳甲(*Epitrix subcrinita*)、塊莖跳甲(*Epitrix tuberis*)，鑽孔蟲(*Faustinus* spp.)、裸蛛甲(*Gibbium psylloides*)、角穀盜蟲(*Gnathocerus cornutus*)、菜心螟(*Hellula undalis*)、異爪犀金龜(*Heteronychus arator*)、寡節觸金龜屬(*Heteronyx* spp.)、秀麗金龜(*Hylamorpha elegans*)、北美家天牛(*Hylotrupes bajulus*)、苜蓿象鼻蟲(*Hypera postica*)、藍綠象鼻蟲(*Hypomeces squamosus*)、果小蠹屬(*Hypothenemus* spp.)，例如咖啡果小蠹(*Hypothenemus hampei*)、蘋枝小蠹(*Hypothenemus obscurus*)、柔毛小蠹蟲(*Hypothenemus pubescens*)，鰓角金龜(*Lachnosterna consanguinea*)、煙甲蟲(*Lasioderma serricorne*)、長頭穀盜(*Latheticus oryzae*)、薪甲(*Lathridius* spp.)、細頸金花蟲屬(*Lema* spp.)、馬鈴薯甲蟲(*Leptinotarsa decemlineata*)、潛蛾屬(*Leucoptera* spp.)，例如咖啡潛葉蛾(*Leucoptera coffeella*)，稻象甲(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、象甲(*Listronotus* (=Hyperodes) spp.)、黃象甲屬(*Lixus* spp.)、葉甲(*Luperodes* spp.)、橫紋寡毛葉蚤(*Luperomorpha xanthodera*)、粉蠹屬(*Lyctus* spp.)、美洲葉甲(*Megascelis* spp.)、梳爪叩頭蟲(*Melanotus* spp.)，例如奧勒岡叩甲(*Melanotus longulus oregonensis*)，花粉甲蟲(*Meligethes aeneus*)、吹粉金龜(*Melolontha* spp.)，例如大栗鰓角金龜(*Melolontha melolontha*)，天牛(*Migdolus* spp.)、墨天牛(*Monochamus* spp.)、象甲(*Naupactus xanthographus*)、琉璃郭公蟲屬(*Necrobia* spp.)、*Neogalerucella* spp.、黃蛛甲(*Niptus hololeucus*)、犀角金龜(*Oryctes rhinoceros*)、鋸胸粉扁蟲(*Oryzaephilus surinamensis*)、*Oryzaphagus oryzae*、鼻蟲(*Otiorhynchus* spp.)，例如蘋果耳象(*Otiorhynchus cribricollis*)、苜蓿象鼻蟲(*Otiorhynchus ligustici*)、草莓耳喙象(*Otiorhynchus ovatus*)、

Otiorhynchus rugosostriatus、黑色藤象鼻蟲(Otiorhynchus sulcatus)、束頸金花蟲屬(Oulema spp.)、例如黑角負泥蟲(Oulema melanopus)、稻負泥蟲(Oulema oryzae)、小青花金龜(Oxycetonia jucunda)、猿葉甲(Phaedon cochleariae)、食葉觸金龜(Phyllophaga spp.)、六月鰓角金龜(Phyllophaga helleri)、條跳甲屬(Phyllotreta spp.)、例如辣根菜跳甲(Phyllotreta armoraciae)、柔弱黑跳甲(Phyllotreta pusilla)、條紋跳甲(Phyllotreta ramosa)、黃條葉蚤(Phyllotreta striolata)、日本麗金龜(Popillia japonica)、小象甲(Premnotrypes spp.)、大穀蠹(Prostephanus truncatus)、跳甲屬(Psylliodes spp.)、例如近緣跳甲(Psylliodes affinis)、油菜藍跳甲(Psylliodes chrysocephala)、甘藍跳甲(Psylliodes punctulata)、蛛甲(Ptinus spp.)、瓢蟲(Rhizobius ventralis)、穀蠹(Rhizopertha dominica)、棕櫚象甲屬(Rhynchophorus spp.)、紅棕象甲(Rhynchophorus ferrugineus)、棕櫚象甲(Rhynchophorus palmarum)、雙棘長蠹(Sinoxylon perforans)、象鼻蟲屬(Sitophilus spp.)、例如穀象(Sitophilus granarius)、羅望子象(Sitophilus linearis)、米象鼻蟲(Sitophilus oryzae)、玉米象(Sitophilus zeamais)、楔象(Sphenophorus spp.)、藥材甲蟲(Stegobium paniceum)、莖象(Sternechus spp.)、例如豆莖象(Sternechus paludatus)、天牛(Symphyletes spp.)、黃褐纖毛象蟲屬(Tanymecus spp.)、例如玉米象鼻蟲(Tanymecus dilaticollis)、Tanymecus indicus、甜菜灰色象蟲(Tanymecus palliatus)、黃粉蟲(Tenebrio molitor)、大穀盜(Tenebrioides mauretanicus)、粉甲(Tribolium spp.)、例如黑擬穀盜(Tribolium audax)、赤擬穀盜(Tribolium castaneum)、扁擬穀盜(Tribolium confusum)、皮蠹(Trogoderma spp.)、象甲(Tychius spp.)、虎天牛(Xylotrechus spp.)、步甲蟲(Zabrus spp.)、例如玉米距步甲(Zabrus tenebrioides)；

來自革翅目，例如濱海肥蠹蝨(Anisolabis maritime)、普通蠹蝨(Forficula

auricularia)、蠼蠋(*Labidura riparia*)；

來自雙翅目(Diptera)，例如斑蚊(*Aedes* spp.)，例如埃及斑蚊(*Aedes aegypti*)、白線斑蚊(*Aedes albopictus*)、叮刺斑蚊(*Aedes sticticus*)、白肋斑蚊(*Aedes vexans*)，潛葉蠅屬(*Agromyza* spp.)，例如寬額斑潛蠅(*Agromyza frontella*)、美洲黍潛蠅(*Agromyza parvicornis*)，按實蠅屬(*Anastrepha* spp.)、瘧蚊(*Anopheles* spp.)，例如四斑瘧蚊(*Anopheles quadrimaculatus*)、岡比亞瘧蚊(*Anopheles gambiae*)、癭蚊屬(*Asphondylia* spp.)、果實蠅屬(*Bactrocera* spp.)，例如瓜實蠅(*Bactrocera cucurbitae*)、東方果實蠅(*Bactrocera dorsalis*)、橄欖果蠅(*Bactrocera oleae*)，全北毛蚊(*Bibio hortulanus*)、紅頭麗蠅(*Calliphora erythrocephala*)、紅頭麗蠅(*Calliphora vicina*)、地中海果實蠅(*Ceratitis capitata*)、搖蚊屬(*Chironomus* spp.)、麗蠅(*Chrysomya* spp.)、斑虻屬(*Chrysops* spp.)、高額麻虻(*Chrysozona pluvialis*)、皮蠅(*Cochliomya* spp.)、癭蚊屬(*Contarinia* spp.)，例如葡萄癭蚊(*Contarinia johnsoni*)、甘藍癭蚊(*Contarinia nasturtii*)、梨癭蚊(*Contarinia pyrivora*)、向日葵癭蚊(*Contarinia schulzi*)、高粱癭蚊(*Contarinia sorghicola*)、麥黃癭蚊(*Contarinia tritici*)，人皮蠅(*Cordylobia anthropophaga*)、環足搖蚊(*Cricotopus sylvestris*)、家蚊(*Culex* spp.)，例如尖音家蚊(*Culex pipiens*)、熱帶家蚊(*Culex quinquefasciatus*)，庫蠅(*Culicoides* spp.)、脈毛蚊屬(*Culiseta* spp.)、黃狂蠅(*Cuterebra* spp.)、油橄欖實蠅(*Dacus oleae*)、葉癭蚊屬(*Dasineura* spp.)，例如油菜莢葉癭蚊(*Dasineura brassicae*)，地種蠅屬(*Delia* spp.)，例如蔥蠅(*Delia antiqua*)、麥地種蠅(*Delia coarctata*)、毛跗地種蠅(*Delia florilega*)、灰地種蠅(*Delia platura*)、甘藍地種蠅(*Delia radicum*)，人膚蠅(*Dermatobia hominis*)、果蠅(*Drosophila* spp.)，例如黑腹果蠅(*Drosophila melanogaster*)、斑翅果蠅(*Drosophila suzukii*)，稻象屬(*Echinocnemus* spp.)、*Euleia heraclei*、

廁蠅(*Fannia* spp.)、胃蠅(*Gastrophilus* spp.)、舌蠅屬(*Glossina* spp.)、麻蛇屬(*Haematopota* spp.)、毛眼水蠅屬(*Hydrellia* spp.)、水稻潛葉蠅(*Hydrellia* *griseola*)、種蠅(*Hylemyia* spp.)、蝨蠅(*Hippobosca* spp.)、皮蠅(*Hypoderma* spp.)、斑潛蠅(*Liriomyza* spp.)，例如菜斑潛蠅(*Liriomyza brassicae*)、南美斑潛蠅(*Liriomyza huidobrensis*)、蔬菜斑潛蠅(*Liriomyza sativae*)，綠蠅(*Lucilia* spp.)，例如銅綠蠅(*Lucilia cuprina*)，沙蠅屬(*Lutzomyia* spp.)、曼蚊屬(*Mansonia* spp.)、蠅屬(*Musca* spp.)，例如家蠅(*Musca domestica*)、家蠅亞種(*Musca domestica vicina*)，狂蠅(*Oestrus* spp.)、瑞典麥稈蠅(*Oscinella* *frit*)、擬長跗搖蚊(*Paratanytarsus* spp.)、*Paralauterborniella subcincta*、泉蠅(*Pegomya* 或 *Pegomyia* spp.)，例如甜菜泉蠅(*Pegomya betae*)、*Pegomya hyoscyami*、懸鉤子泉蠅(*Pegomya rubivora*)，蛉(*Phlebotomus* spp.)、麥蠅(*Phorbia* spp.)、伏蠅屬(*Phormia* spp.)、酪蠅(*Piophilila casei*)、蘆筍蠅(*Platyparea poeciloptera*)、*Prodiplosis* spp.、胡蘿蔔蠅(*Psila rosae*)、繞實蠅(*Rhagoletis* spp.)，例如櫻桃實蠅(*Rhagoletis cingulata*)、核桃繞實蠅(*Rhagoletis completa*)、黑櫻桃實蠅(*Rhagoletis fausta*)、西部櫻桃實蠅(*Rhagoletis indifferens*)、藍橘繞實蠅(*Rhagoletis mendax*)、蘋果繞實蠅(*Rhagoletis pomonella*)，肉蠅(*Sarcophaga* spp.)、蚋(*Simulium* sp.)，例如南方蚋(*Simulium meridionale*)，螫蠅(*Stomoxys* spp.)、虻(*Tabanus* spp.)、*Tetanops* spp.、大蚊(*Tipula* spp.)，例如沼澤大蚊(*Tipula paludosa*)、牧場大蚊(*Tipula simplex*)、木瓜實蠅(*Toxotrypana curvicauda*)；

來自半翅目，例如例如木蝨(*Acizzia acaciaebaileyanae*)、木蝨(*Acizzia dodonaeae*)、木蝨(*Acizzia uncatoides*)、狹背蚱猛(*Acrida turrita*)、蚜(*Acyrtosiphon* spp.)，例如豌豆蚜(*Acyrtosiphon pisum*)、*Acrogonia* spp.、金蝨(*Aeneolamia* spp.)、木蝨(*Agonosцена* spp.)、刺粉蝨(*Aleurocanthus* spp.)、

Aleyrodes proletella、甘蔗穴粉蝨(*Aleurolobus barodensis*)、棉絮粉蝨(*Aleurothrixus floccosus*)、馬來西亞木蝨(*Allocaridara malayensis*)、葉蟬(*Amrasca* spp.)，例如二點小綠葉蟬(*Amrasca bigutulla*)、小葉蟬(*Amrasca devastans*)，紅蚜(*Anuraphis cardui*)、圓盾蚧(*Aonidiella* spp.)，例如橘紅腎圓盾介殼蟲(*Aonidiella aurantii*)、橘黃腎圓盾介殼蟲(*Aonidiella citrina*)、木瓜腎圓盾介殼蟲(*Aonidiella inornata*)，梨矮蚜圓盾蚧(*Aphanostigma piri*)、蚜蟲(*Aphis* spp.)，例如橘捲葉蚜(*Aphis citricola*)、豆蚜(*Aphis craccivora*)、甜菜蚜(*Aphis fabae*)、草莓根蚜(*Aphis forbesi*)、大豆蚜(*Aphis glycines*)、綿蚜(*Aphis gossypii*)、常春藤蚜(*Aphis hederæ*)、葡萄藤蚜(*Aphis illinoisensis*)、(*Aphis middletoni*)、鼠李馬鈴薯蚜(*Aphis nasturtii*)、夾竹桃蚜(*Aphis nerii*)、蘋果蚜(*Aphis pomi*)、捲葉蚜(*Aphis spiraeicola*)、*Aphis viburniphila*，葡萄浮塵子(*Arboridia apicalis*)、*Arytainilla* spp.、圓盾介殼蟲(*Aspidiella* spp.)、圓蚧(*Aspidiotus* spp.)，例如夾竹桃圓蚧(*Aspidiotus nerii*)，葉蟬(*Atanus* spp.)、馬鈴薯蚜(*Aulacorthum solani*)、菸草粉蝨(*Bemisia tabaci*)、*Blastopsylla occidentalis*、白千層木蝨(*Boreioglycaspis melaleucae*)、光管舌尾蚜(*Brachycaudus helichrysi*)、微管蚜(*Brachycolus* spp.)、甘藍蚜(*Brevicoryne brassicae*)、梨木蝨(*Cacopsylla* spp.)，例如梨黃木蝨(*Cacopsylla pyricola*)，飛蝨(*Calligypona marginata*)、*Capulinia* spp.、麗黃頭大葉蟬(*Carneocephala fulgida*)、甘蔗棉蚜(*Ceratovacuna lanigera*)、沫蟬(*Cercopidae*)、蠟蚧(*Ceroplastes* spp.)、草莓毛管蚜(*Chaetosiphon fragaefolii*)、印尼雪盾蚧(*Chionaspis tegalensis*)、葉蟬(*Chlorita onukii*)、*Chondracris rosea*、核桃黑斑蚜(*Chromaphis juglandicola*)、褐圓盾介殼蟲(*Chrysomphalus aonidum*)、褐圓介殼蟲(*Chrysomphalus ficus*)、葉蟬(*Cicadulina mbila*)、盾蚧(*Coccoomytilus halli*)、堅介殼蟲(*Coccus* spp.)，例如扁堅介殼蟲 *Coccus*

hesperidum 、長堅介殼蟲 (*Coccus longulus*) 、桔堅介殼蟲 (*Coccus pseudomagnoliarum*)、綠介殼蟲 (*Coccus viridis*)、隱瘤蚜 (*Cryptomyzus ribis*)、*Cryptoneossa* spp.、*Ctenarytaina* spp.、葉蟬 (*Dalbulus* spp.)、粉蝨 (*Dialeurodes citri*)、橘雲翅粉蝨 (*Dialeurodes chittendeni*)、柑桔裸粉蝨 (*Dialeurodes citri*)、木蝨 (*Diaphorina citri*)、盾蚧 (*Diaspis* spp.)、雙尾蚧 (*Diuraphis* spp.)、*Doralis* spp.、草履蚧 (*Drosicha* spp.)、圓尾蚧 (*Dysaphis* spp.)、例如 *Dysaphis apiifolia*、車前草蚧 (*Dysaphis plantaginea*)、百合西圓尾蚧 (*Dysaphis tulipae*)、粉蚧 (*Dysmicoccus* spp.)、小綠葉蟬 (*Empoasca* spp.)、例如西部馬鈴薯葉蟬 (*Empoasca abrupta*)、馬鈴薯小綠葉蟬 (*Empoasca fabae*)、蘋果小綠葉蟬 (*Empoasca maligna*)、索拉納小綠葉 (*Empoasca solana*)、史提夫葉蟬 (*Empoasca stevensi*)、綿蚧 (*Eriosoma* spp.)、例如美國綿蚧 (*Eriosoma americanum*)、蘋果綿蚧 (*Eriosoma lanigerum*)、梨綿蚧 (*Eriosoma pyricola*)、斑葉蟬 (*Erythroneura* spp.)、*Eucalyptolyma* spp.、*Euphyllura* spp.、雙葉葉蟬 (*Euscelis bilobatus*)、腺刺粉蚧屬 (*Ferrisia* spp.)、圍盾介殼蟲 (*Fiorinia* spp.)、箭頭介殼蟲 (*Furcaspis oceanica*)、咖啡地粉蚧 (*Geococcus coffeae*)、*Glycaspis* spp.、銀合歡木蝨 (*Heteropsylla cubana*)、頰木蝨 (*Heteropsylla spinulosa*)、琉璃葉蟬 (*Homalodisca coagulata*)、桃粉蚧 (*Hyalopterus arundinis*)、桃粉蚧 (*Hyalopterus pruni*)、吹綿蚧 (*Icerya* spp.)、例如吹綿介殼蟲 (*Icerya purchasi*)、片角葉蟬 (*Idiocerus* spp.)、褐葉蟬 (*Idioscopus* spp.)、灰飛蝨 (*Laodelphax striatellus*)、球蚧 (*Lecanium* spp.)、例如木堅介殼蟲 (*Lecanium corni*) (= *Parthenolecanium corni*)、蠟盾蚧 (*Lepidosaphes* spp.)、例如榆蠟盾介殼蟲 (*Lepidosaphes ulmi*)、偽菜蚧 (*Lipaphis erysimi*)、日本長片盾介殼蟲 (*Lopholeucaspis japonica*)、斑衣蠟蟬 (*Lycorma delicatula*)、長管蚧 (*Macrosiphum* spp.)、例如馬鈴薯長管蚧 (*Macrosiphum euphorbiae*)、百合紫

斑長管蚜(*Macrosiphum lili*)、薔薇長管蚜(*Macrosiphum rosae*)，二點葉蜂(*Macrosteles facifrons*)、沫蝶屬(*Mahanarva* spp)、高粱黍蚜(*Melanaphis sacchari*)、蚜(*Metcalfiella* spp.)、蛾蠟蟬(*Metcalfa pruinosa*)、麥無網長管蚜(*Metopolophium dirhodum*)、黃胡桃蚜(*Monellia costalis*)、黃胡桃蚜(*Monelliopsis pecanis*)、瘤額蚜(*Myzus* spp.)，例如冬蔥瘤額蚜(*Myzus ascalonicus*)、李瘤蚜(*Myzus cerasi*)、女貞瘤額蚜(*Myzus ligustri*)、莖菜瘤蚜(*Myzus ornatus*)、桃蚜(*Myzus persicae*)、煙蚜(*Myzus nicotianae*)，萵苣蚜(*Nasonovia ribisnigri*)、新馬粉蝨屬(*Neomaskellia* spp.)、黑尾葉蟬(*Nephotettix* spp.)，例如偽黑尾葉蟬(*Nephotettix cincticeps*)、黑條黑尾葉蟬(*Nephotettix nigropictus*)、*Nettigniclla spectra*、褐飛蝨(*Nilaparvata lugens*)、葉蟬(*Oncometopia* spp.)、長旌蚧(*Orthezia praelonga*)、中華稻蝗(*Oxya chinensis*)、芽瘦木蝨屬(*Pachypsylla* spp.)、楊梅粉蝨(*Parabemisia myricae*)、木蝨(*Paratrioza* spp.)，例如 *Paratrioza cockerelli*，片盾蚧(*Parlatoria* spp.)、癭綿蚜(*Pemphigus* spp.)，例如囊柄癭綿蚜(*Pemphigus bursarius*)、多脈癭綿蚜(*Pemphigus populivenae*)，玉米飛蝨(*Peregrinus maidis*)、扁角飛蝨(*Perkinsiella* spp.)、綿粉蚧(*Phenacoccus* spp.)，例如美地綿粉介殼蟲(*Phenacoccus madeirensis*)，平翅綿蚜(*Phloeomyzus passerinii*)、忽布瘤額蚜(*Phorodon humuli*)、根瘤蚜(*Phylloxera* spp.)，例如美核桃根瘤蚜(*Phylloxera devastatrix*)、警根瘤蚜(*Phylloxera notabilis*)，褐點並盾蚧(*Pinnaspis aspidistrae*)、粉蚧(*Planococcus* spp.)，例如柑桔粉介殼蟲(*Planococcus citri*)、*Prosopidopsylla flava*、梨形原綿臘蚧(*Protopulvinaria pyriiformis*)、桑擬輪盾蚧(*Pseudaulacaspis pentagona*)、粉介殼蟲(*Pseudococcus* spp.)，例如嗜桔粉蚧(*Pseudococcus calceolariae*)、康氏粉蚧(*Pseudococcus comstocki*)、長尾粉介殼蟲(*Pseudococcus longispinus*)、葡萄粉蚧(*Pseudococcus maritimus*)、暗

色粉蚧(*Pseudococcus viburni*)、*Psyllopsis* spp.、木蝨(*Psylla* spp.)，例如 *Psylla buxi*、梨木蝨(*Psylla mali*)、蘋果木蝨(*Psylla pyri*)，金小蜂(*Pteromalus* spp.)、綿介殼蟲屬(*Pulvinaria* spp.)、皮蠟蟬蟬(*Pyrilla* spp.)、圓蚧(*Quadraspidotus* spp.)，例如胡桃圓盾蚧(*Quadraspidotus juglansregiae*)、楊笠圓盾蚧(*Quadraspidotus ostreaeformis*)、梨齒盾蚧(*Quadraspidotus perniciosus*)，楊圓蚧(*Quesada gigas*)、平刺粉蚧(*Rastrococcus* spp.)、縊管蚜(*Rhopalosiphum* spp.)，例如玉米蚜(*Rhopalosiphum maidis*)、*Rhopalosiphum oxyacanthae*、稻麥蚜(*Rhopalosiphum padi*)、紅腹縊管蚜(*Rhopalosiphum rufiabdominale*)，硬蚧(*Saissetia* spp.)，例如咖啡硬介殼蟲(*Saissetia coffeae*)、*Saissetia miranda*、*Saissetia neglecta*、工脊硬介殼蟲(*Saissetia oleae*)，扁帶葉蟬(*Scaphoides titanus*)、麥二叉蚜(*Schizaphis graminum*)、刺盾蚧(*Selenaspidus articulatus*)、甘蔗黃蚜(*Sipha flava*)、麥長管蚜(*Sitobion avenae*)、飛蝨(*Sogatata* spp.)、白背飛蝨(*Sogatella furcifera*)、飛蝨(*Sogatodes* spp.)、角蟬(*Stictocephala festina*)、椿粉蝨(*Siphoninus phillyrae*)、馬來蝨(*Tenalaphara malayensis*)、*Tetragonocephala* spp.、斑蚜(*Tinocallis caryaefoliae*)、沫蟬(*Tomaspis* spp.)、二叉蚜(*Toxoptera* spp.)，例如小桔蚜(*Toxoptera aurantii*)、大桔蚜(*Toxoptera citricidus*)，溫室白粉蝨(*Trialeurodes vaporariorum*)、木蝨(*Trioza* spp.)，例如柿木蝨(*Trioza diospyri*)，小葉蟬(*Typhlocyba* spp.)、矢尖蚧(*Unaspis* spp.)、葡萄根瘤蚜(*Viteus vitifolii*)、斑葉蜂(*Zygina* spp.)；

來自於異翅亞目(*Heteroptera*)，例如麥蝽屬(*Aelia* spp.)、南瓜緣蝽(*Anasa tristis*)、椿象(*Antestiopsis* spp.)、*Boisea* spp.、長蝽(*Blissus* spp.)、盲蝽(*Calocoris* spp.)、盲蝽(*Campylomma livida*)、長椿(*Cavelerius* spp.)、臭蟲(*Cimex* spp.)，例如 *Cimex adjunctus*、熱帶臭蟲(*Cimex hemipterus*)、溫帶臭蟲(*Cimex lectularius*)、蝠臭蟲(*Cimex pilosellus*)，*Collaria* spp.、綠盲蝽

(*Creontiades dilutus*)、胡椒黛緣蝽(*Dasynus piperis*)、臭蟲(*Dichelops furcatus*)、黑網蝽(*Diconocoris hewetti*)、紅蝽(*Dysdercus* spp.)、臭蝽(*Euschistus* spp.)，例如大豆褐蝽(*Euschistus heros*)、褐椿(*Euschistus servus*)、*Euschistus tristigmus*、斑點美洲蝽(*Euschistus variolarius*)、菜蝽(*Eurydema* spp.)、盾蝽(*Eurygaster* spp.)、*Halyomorpha halys*、角盲蝽(*Heliopeltis* spp.)、棉花蟲(*Horcias nobilellus*)、緣蝽(*Leptocorisa* spp.)、異稻緣蝽(*Leptocorisa varicornis*)、西部稻緣蝽(*Leptoglossus occidentalis*)、葉足緣蝽(*Leptoglossus phyllopus*)、綠盲蝽(*Lygocoris* spp.)，例如原麗盲蝽(*Lygocoris pabulinus*)、草盲蝽(*Lygus* spp.)，例如豆莢灰盲蝽(*Lygus elisus*)、西部牧草盲蝽(*Lygus hesperus*)、*Lygus lineolaris*、巨股長蝽(*Macropes excavatus*)、篩豆龜椿(*Megacopta cribraria*)、盲蝽(*Miridae*)、*Monalonion atratum*、稻綠蝽(*Nezara* spp.)，例如南方稻綠蝽(*Nezara viridula*)、小長椿屬(*Nysius* spp.)、稻蝽(*Oebalus* spp.)、蝽科(*Pentomidae*)、皮蝽(*Piesma quadrata*)、蝽象(*Piezodorus* spp.)，例如紅蝽(*Piezodorus guildinii*)、雜盲蝽(*Psallus* spp.)、網蝽(*Pseudacysta perseae*)、錐鼻蟲(*Rhodnius* spp.)、盲蝽(*Sahlbergella singularis*)、*Scaptocoris castanea*、黑蝽(*Scotinophora* spp.)、梨冠網蝽(*Stephanitis nashi*)、稻蝽(*Tibraca* spp.)、錐鼻蟲(*Triatoma* spp.)；

來自於膜翅目(*Hymenoptera*)，例如刺切葉蟻(*Acromyrmex* spp.)、葉蜂(*Athalia* spp.)，例如菜葉蜂(*Athalia rosae*)、切葉蟻(*Atta* spp.)、巨山蟻屬(*Camponotus* spp.)、長黃胡蜂(*Dolichovespula* spp.)、葉蜂(*Diprion* spp.)，例如白松葉蜂(*Diprion similis*)、葉蜂(*Hoplocampa* spp.)，例如櫻實葉蜂(*Hoplocampa cookei*)、蘋實葉蜂(*Hoplocampa testudinea*)、田蟻(*Lasius* spp.)、阿根廷蟻(*Linepithema (Iridomyrmex) humile*)、小黃家蟻(*Monomorium pharaonis*)、黃山蟻屬(*Paratrechina* spp.)、胡蜂(*Paravespula* spp.)、箭蟻屬

(*Plagiolepis* spp.)、樹蜂(*Sirex* spp.)、紅火蟻(*Solenopsis invicta*)、酸臭蟻(*Tapinoma* spp.)、白足扁琉璃蟻(*Technomyrmex albipes*)、大樹蜂(*Urocerus* spp.)、胡蜂(*Vespa* spp.)，例如黃邊胡蜂(*Vespa crabro*)、小火蟻(*Wasmannia auropunctata*)、*Xeris* spp.；

來自等足目(*Isopoda*)，例如平甲蟲(*Armadillidium vulgare*)、壁潮蟲(*Oniscus asellus*)、球鼠婦(*Porcellio scaber*)；

來自於等翅目(*Isoptera*)，例如家白蟻屬(*Coptotermes* spp)，例如台灣家白蟻(*Coptotermes formosanus*)，堆角白蟻(*Cornitermes cumulans*)、堆砂白蟻屬(*Cryptotermes* spp.)、楹白蟻屬(*Incisitermes* spp)、木白蟻屬(*Kaloterme*s spp.)、稻麥小白蟻(*Microtermes obesi*)、象白蟻(*Nasutitermes* spp)、土白蟻(*Odontotermes* spp.)、孔白蟻(*Porotermes* spp.)、散白蟻(*Reticulitermes* spp)，例如黃肢散白蟻(*Reticulitermes flavipes*)、西方犀白蟻(*Reticulitermes hesperus*)；

來自於鱗翅目(*Lepidoptera*)，例如小蠟螟(*Achroia grisella*)、桑劍紋夜蛾(*Acronicta major*)、褐帶卷蛾(*Adoxophyes* spp.)，例如棉褐帶卷蛾(*Adoxophyes orana*)，白斑煩夜蛾(*Aedia leucomelas*)、地夜蛾(*Agrotis* spp.)，例如黃地夜蛾(*Agrotis segetum*)、球莖夜蛾(*Agrotis ipsilon*)，木棉蟲(*Alabama* spp)，例如棉葉波紋夜蛾(*Alabama argillacea*)，臍橙螟蛾(*Amyelois transitella*)、麥蛾屬(*Anarsia* spp.)、夜蛾(*Anticarsia* spp)，例如大豆夜蛾(*Anticarsia gemmatilis*)，*Argyroploce* spp.、夜蛾屬(*Autographa* spp.)、甘藍夜蛾(*Barathra brassicae*)、蘋蘗尖蛾(*Blastodacna atra*)、禾弄蝶(*Borbo cinnara*)、潛葉蛾(*Bucculatrix thurberiella*)、松尺蠖(*Bupalus piniarius*)、蛀莖夜蛾(*Busseola* spp.)、卷蛾(*Cacoecia* spp)、茶細蛾(*Caloptilia theivora*)、夜蛾(*Capua reticulana*)、蘋果蠹蛾(*Carpocapsa pomonella*)、桃蛀果蛾(*Carposina*

niponensis)、唇口蟲(*Cheimatobia brumata*)、螟(*Chilo* spp.)，例如 *Chilo plejadellus*、二化螟(*Chilo suppressalis*)、蘋果舞蛾(*Choreutis pariana*)、棕色卷蛾(*Choristoneura* spp)、葡萄果蠹蛾(*Clysia ambiguella*)、捲葉螟(*Cnaphalocerus* spp.)、稻縱卷葉螟(*Cnaphalocrocis medinalis*)、雲卷蛾屬(*Cnephasia* spp.)、細蛾(*Conopomorpha* spp.)、酪梨象屬(*Conotrachelus* spp.)、*Copitarsia* spp.、小卷蛾屬(*Cydia* spp.)，例如豆莢小卷蛾(*Cydia nigricana*)、蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella*)、*Dalaca noctuides*、絹野螟屬(*Diaphania* spp.)、棉鈴蟲(*Diparopsis* spp.)、小蔗桿草螟(*Diatraea saccharalis*)、鑽夜蛾(*Earias* spp)、*Ecdytolopha aurantium*、南美玉米苗斑螟(*Elasmopalpus lignosellus*)、甘薯桿螟(*Eldana saccharina*)、粉斑螟(*Ephestia* spp)，例如煙草粉螟(*Ephestia elutella*)、地中海粉斑螟(*Ephestia kuehniella*)，葉小卷蛾屬(*Epinotia* spp.)、淡褐蘋果蛾(*Epiphyas postvittana*)、尺蛾(*Erannis* spp.)、*Erschoviella musculan*、莢斑螟屬(*Etiella* spp.)、木夜蛾(*Eudocima* spp.)、掠卷蛾屬(*Eulia* spp.)、環針單紋蛾(*Eupoecilia ambiguella*)、黃毒蛾(*Euproctis* spp)，例如褐尾毒蛾(*Euproctis chrysorrhoea*)，切根蟲(*Euxoa* spp.)、夜蛾(*Feltia* spp.)、蠟螟(*Galleria mellonella*)、細蛾屬(*Gracillaria* spp.)、蠹蛾屬(*Grapholita* spp.)，例如桃折心蟲(*Grapholita molesta*)、蘋小果蠹(*Grapholita prunivora*)、蝕葉野螟屬(*Hedylepta* spp.)、棉鈴蟲(*Helicoverpa* spp.)，例如棉鈴實夜蛾(*Helicoverpa armigera*)、穀實夜蛾(*Helicoverpa zea*)，夜蛾(*Heliothis* spp.)，例如煙芽夜蛾(*Heliothis virescens*)，褐織葉螟(*Hofmannophila pseudospretella*)、同斑螟(*Homoeosoma* spp.)、捲葉蛾(*Homona* spp)、蘋果巢蛾(*Hyponomeuta padella*)、柿蒂蟲(*Kakivoria flavofasciata*)、小灰蝶(*Lampides* spp)、夜蛾(*Laphygma* spp.)、梨小蠹螟(*Laspeyresia molesta*)、茄白翅野螟(*Leucinodes orbonalis*)、紋潛蛾屬(*Leucoptera* spp.)，例如咖啡潛

葉蛾(*Leucoptera coffeella*)，細蛾(*Lithocolletis* spp.)，例如斑幕潛葉蛾(*Lithocolletis blancardella*)，觸角蛾(*Lithophane antennata*)、花翅小卷蛾(*Lobesia* spp.)，例如葡萄藤蛾(*Lobesia botrana*)，西方豆夜蛾(*Loxagrotis albicosta*)、毒蛾(*Lymantria* spp.)，例如舞毒蛾(*Lymantria dispar*)，潛蛾(*Lyonetia* spp.)，例如桃潛葉蛾(*Lyonetia clerkella*)、天幕枯葉蛾(*Malacosoma neustria*)、*Maruca testulalis*、甘藍夜蛾(*Mamestra brassicae*)、暮眼蝶(*Melanitis leda*)、夜蛾(*Mocis* spp.)、*Monopis obviella*、粘蟲(*Mythimna separata*)、橡長角蛾(*Nemapogon cloacellus*)、水螟屬(*Nymphula* spp.)、*Oiketicus* spp.、螟蛾(*Omphisa* spp.)、秋尺蛾屬(*Operophtera* spp.)、蠅(*Oria* spp.)、瘤叢螟屬(*Orthaga* spp.)、桿野螟屬(*Ostrinia* spp.)，例如歐洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis*)、冬夜蛾(*Panolis flammea*)、*Parnara* spp.、棉紅鈴蟲(*Pectinophora* spp.)，例如棉紅鈴蟲(*Pectinophora gossypiella*)、潛跳甲屬(*Perileucoptera* spp.)、麥蛾屬(*Phthorimaea* spp.)，例如馬鈴薯塊莖蛾(*Phthorimaea operculella*)，柑桔潛葉蛾(*Phyllocnistis citrella*)、細蛾(*Phyllonorycter* spp.)，例如斑幕潛葉蛾(*Phyllonorycter blancardella*)、山楂潛葉蛾(*Phyllonorycter crataegella*)，粉蝶(*Pieris* spp.)，例如白粉蝶(*Pieris rapae*)，荷蘭石竹小卷蛾(*Platynota stultana*)、印度穀螟(*Plodia interpunctella*)、金翅夜蛾屬(*Plusia* spp.)、小菜蛾(*Plutella xylostella*) (= *Plutella maculipennis*)、*Prays* spp.、夜蛾(*Prodenia* spp.)、菸草天蛾(*Protoparce* spp.)、黏夜蛾(*Pseudaletia* spp.)，例如星黏蟲(*Pseudaletia unipuncta*)、大豆夜蛾(*Pseudoplusia includens*)、玉米螟(*Pyrausta nubilalis*)、向日葵尺蠖(*Rachiplusia nu*)、禾螟屬(*Schoenobius* spp.)，例如三化螟(*Schoenobius bipunctifer*)，白禾螟屬(*Scirpophaga* spp.)，例如稻白禾螟(*Scirpophaga innotata*)、*Scotia segetum*、蛀莖夜蛾屬(*Sesamia* spp.)，例如稻蛀莖夜蛾(*Sesamia inferens*)、長須卷蛾屬(*Sparganothis* spp.)、灰翅夜蛾屬

(*Spodoptera* spp.)，例如甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua*)、秋行軍蟲(*Spodoptera frugiperda*)、西部黃條粘蟲夜蛾(*Spodoptera praefica*)，舉肢蛾屬(*Stathmopoda* spp.)、*Stenoma* spp.、花生麥蛾(*Stomopteryx subsecivella*)、透翅蛾屬(*Synanthedon* spp.)、安第斯馬鈴薯塊莖蛾(*Tecia solanivora*)、異舟蛾(*Thaumetopoea* spp.)、黎豆夜蛾(*Thermesia gemmatalis*)、木塞穀蛾(*Tinea cloacella*)、帶殼衣蛾(*Tinea pellionella*)、衣蛾(*Tineola bisselliella*)、櫟綠卷蛾(*Tortrix* spp.)、毛毯衣蛾(*Trichophaga tapetzella*)、粉夜蛾屬(*Trichoplusia* spp.)，例如粉紋夜蛾(*Trichoplusia ni*)，三化螟(*Tryporyza incertulas*)、番茄斑潛蠅(*Tuta absoluta*)、灰蝶屬(*Virachola* spp.)；

來自直翅目(*Orthoptera*)或跳躍亞目(*Saltatoria*)，例如蟋蟀(*Acheta domesticus*)、*Dichroplus* spp.、螻蛄(*Gryllotalpa* spp.)，例如短翅螻蛄(*Gryllotalpa gryllotalpa*)，蔗蝗(*Hieroglyphus* spp.)、飛蝗(*Locusta* spp.)，例如東亞飛蝗(*Locusta migratoria*)，黑蝗(*Melanoplus* spp.)，例如赤地蚱蜢(*Melanoplus devastator*)，烏蘇里擬寰螽(*Paratlanticus ussuriensis*)、沙漠蝗蟲(*Schistocerca gregaria*)；

來自蝨目(*Phthiraptera*)，例如叮咬蝨(*Damalinia* spp.)、吸血蝨(*Haematopinus* spp.)、顎蝨(*Linognathus* spp.)、體蝨(*Pediculus* spp.)、根瘤蚜(*Phylloera vastatrix*)、陰蝨(*Phthirus pubis*)、毛蝨(*Trichodectes* spp.)；

來自嚙蟲目(*Psocoptera*)，例如鱗蟲齒屬(*Lepinotus* spp.)、書蝨屬(*Liposcelis* spp.)；

來自蚤目(*Siphonaptera*)，例如角葉蚤(*Ceratophyllus* spp.)、櫛頭蚤(*Ctenocephalides* spp.)，例如狗蚤(*Ctenocephalides canis*)、貓蚤(*Ctenocephalides felis*)，致癢蚤(*Pulex irritans*)、穿皮潛蚤(*Tunga penetrans*)、印度鼠蚤(*Xenopsylla cheopis*)；

來自於縷翅目(Thysanoptera)，例如玉米黃呆薊馬(*Anaphothrips obscurus*)、稻薊馬(*Baliothrips biformis*)、中斑圍孔薊馬(*Chaetanaphothrips leeuweni*)、葡萄鐮薊馬(*Drepanothrips reuteri*)、薊馬(*Enneothrips flavens*)、薊馬(*Frankliniella* spp.)，例如煙褐花薊馬(*Frankliniella fusca*)、西方花薊馬(*Frankliniella occidentalis*)、梳缺花薊馬(*Frankliniella schultzei*)、麥花薊馬(*Frankliniella tritici*)、越桔花薊馬(*Frankliniella vaccinii*)、玉米薊馬(*Frankliniella williamsi*)、簡管薊馬屬(*Haplothrips* spp.)、薊馬(*Heliothrips* spp.)、栗網薊馬(*Hercinothrips femoralis*)、卡薊馬屬(*Kakothrips* spp.)、腹鉤薊馬(*Rhipiphorothrips cruentatus*)、薊馬(*Scirtothrips* spp.)、薊馬(*Taeniothrips cardamoni*)、薊馬(*Thrips* spp.)，例如南黃薊馬(*Thrips palmi*)、蔥薊馬(*Thrips tabaci*)；

來自於 *Zygentoma* (衣魚亞目)(=縷尾目(Thysanura))，例如柿衣魚(*Ctenolepisma* spp.)、衣魚(*Lepisma saccharina*)、盜火蟲(*Lepismodes inquilinus*)、家衣魚(*Thermobia domestica*)；

來自於綜合綱(Symphyla)，例如蚰蜒屬(*Scutigera* spp.)，例如白松蟲(*Scutigera immaculata*)；

來自軟體動物門之害蟲，特別是來自雙殼綱(Bivalvia)，例如貽貝屬(*Dreissena* spp.)，

以及來自於腹足綱(Gastropoda)，例如蛞蝓(*Arion* spp.)，例如 *Arion ater rufus*，扁蝨(*Biomphalaria* spp.)、水泡螺(*Bulinus* spp.)、野蛞蝓(*Deroceras* spp.)，例如光滑野蛞蝓(*Deroceras leae*)，椎實螺(*Galba* spp.)、錐實螺(*Lymnaea* spp.)、釘螺(*Oncomelania* spp.)、福壽螺屬(*Pomacea* spp.)、琥珀螺(*Succinea* spp.)；

來自線蟲動物門之植物害蟲，亦即植物寄生性線蟲，特別是野外墊刃線蟲

(*Aglenchus* spp.)，例如居農野外墊刃線蟲(*Aglenchus agricola*)，腫癭線蟲(*Anguina* spp.)，例如小麥粒癭線蟲(*Anguina tritici*)、葉芽線蟲(*Aphelenchoides* spp.)，例如花生葉芽線蟲(*Aphelenchoides arachidis*)、草莓葉芽線蟲(*Aphelenchoides fragariae*)、刺線蟲(*Belonolaimus* spp.)，例如細小刺線蟲(*Belonolaimus gracilis*)、長尾刺線蟲(*Belonolaimus longicaudatus*)、諾頓刺線蟲(*Belonolaimus nortoni*)、傘滑刃線蟲(*Bursaphelenchus* spp.)，例如椰子紅環腐線蟲(*Bursaphelenchus cocophilus*)、*Bursaphelenchus eremus*、松材線蟲(*Bursaphelenchus xylophilus*)、固著線蟲(*Cacopaurus* spp.)，例如有害壞死線蟲(*Cacopaurus pestis*)、小環線蟲(*Criconemella* spp.)，例如彎曲小環線蟲(*Criconemella curvata*)、(*Criconemella onoensis*)、裝飾小環線蟲(*Criconemella ornata*)、*Criconemella rusium*、薄葉小環線蟲(*Criconemella xenoplax*)(= *Mesocriconema xenoplax*)、環紋線蟲(*Criconemoides* spp.)，例如弗尼亞環紋線蟲(*Criconemoides ferniae*)、*Criconemoides onoense*、*Criconemoides ornatum*、莖線蟲(*Ditylenchus* spp.)，例如鱗球莖線蟲(*Ditylenchus dipsaci*)、錐線蟲(*Dolichodorus* spp.)、孢囊線蟲(*Globodera* spp.)，例如馬鈴薯孢囊線蟲(*Globodera pallida*)、黃金線蟲(*Globodera rostochiensis*)、螺旋線蟲(*Helicotylenchus* spp.)，例如雙宮螺旋線蟲(*Helicotylenchus dihystra*)、半輪線蟲(*Hemicriconemoides* spp.)、鞘線蟲(*Hemicyclophora* spp.)、孢囊線蟲(*Heterodera* spp.)，例如禾穀孢囊線蟲(*Heterodera avenae*)、大豆孢囊線蟲(*Heterodera glycines*)、甜菜孢囊線蟲(*Heterodera schachtii*)、穿根線蟲屬(*Hirschmaniella* spp.)、紐帶線蟲(*Hoplolaimus* spp.)、長針線蟲(*Longidorus* spp.)，例如非洲長針線蟲(*Longidorus africanus*)、根結線蟲(*Meloidogyne* spp.)，例如奇氏根結線蟲(*Meloidogyne chitwoodi*)、偽根結線蟲(*Meloidogyne fallax*)、北方根結線蟲(*Meloidogyne hapla*)、南方根結線蟲

(*Meloidogyne incognita*)、瓢線蟲(*Meloinema* spp.)、假根瘤線蟲(*Nacobbus* spp.)、擬莖線蟲(*Neotylenchus* spp.)、擬針線蟲屬(*Paralongidorus* spp.)、擬滑刃線蟲(*Paraphelenchus* spp.)、擬毛刺線蟲(*Paratrichodorus* spp.)，例如較小擬毛刺線蟲(*Paratrichodorus minor*)、根腐線蟲(*Pratylenchus* spp.)，例如穿刺根腐線蟲(*Pratylenchus penetrans*)、*Pseudohalenchus* spp.、平滑線蟲屬(*Psilenchus* spp.)、斑皮線蟲(*Punctodera* spp.)、五溝線蟲(*Quinisulcius* spp.)、穿孔線蟲屬(*Radopholus* spp.)，例如柑橘穿孔線蟲(*Radopholus citrophilus*)、香蕉穿孔線蟲(*Radopholus similis*)、腎形線蟲(*Rotylenchulus* spp.)、盤旋線蟲(*Rotylenchus* spp.)、盾狀線蟲(*Scutellonema* spp.)、亞洲蛇形線蟲(*Subanguina* spp.)、毛刺線蟲(*Trichodorus* spp.)，例如鈍毛刺線蟲(*Trichodorus obtusus*)、原始毛刺線蟲(*Trichodorus primitivus*)、矮化線蟲(*Tylenchorhynchus* spp.)，例如飾環矮化線蟲(*Tylenchorhynchus annulatus*)、半穿刺線蟲(*Tylenchulus* spp.)，例如柑橘半穿刺線蟲(*Tylenchulus semipenetrans*)、劍線蟲屬(*Xiphinema* spp.)，例如標準劍線蟲(*Xiphinema index*)。

式(I)或式(I')之化合物可視情況，以特定的濃度或施用率，亦可用作為除草劑、安全劑、生長調節劑或改善植物性質之試劑或作為抗微生物劑或殺配子劑，例如作為殺真菌劑、抗黴劑、殺細菌劑、殺病毒劑(包括抗類病毒之試劑)或作為抗 MLO (擬菌質體)和 RLO (類立克次體)之試劑。視情況，其亦可作為合成其他活性成份之中間物或前驅物。

調配物

本發明進一步係關於調配物以及從其所製備作為除害劑，例如包括至少一種式(I)或式(I')之化合物之浸液、滴劑和噴液的使用形式。視需要，使用形式係包括另外的殺蟲劑及/或改善作用之輔助劑，例如滲透劑，例如

植物油，例如菜籽油、葵花油、礦物油，例如石蠟油，植物脂肪酸之烷基酯，例如菜籽油甲基酯或大豆油甲基酯，或烷醇烷氧化物及/或擴散劑，例如烷基矽氧烷及/或鹽類，例如有機或無機銨或磷鹽，例如硫酸銨或磷酸氫二銨，及/或助留劑，例如磺基琥珀酸二辛酯或羥基丙基關華豆膠聚合物，及/或保濕劑，例如甘油，及/或肥料，例如含銨、鉀或磷的肥料。

習用的調配物有，例如水性溶液(SL)、乳劑(EC)、水基乳劑(EW)、懸浮劑(SC、SE、FS、OD)、水分散性粒劑(WG)、顆粒(GR)和膠囊懸劑(CS)；這些和另外的可能調配物類型係描述於，例如 Crop Life International and in Pesticide Specifications ; Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides ; FAO Plant Production and Protection Papers – 173, prepared by the FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576 中。此等調配物，除了一或多種式(I)或式(I')之化合物之外，視需要係包括另外的活性農化成份。

較佳的為包括輔助劑，例如增量劑、溶劑、自發促進劑、載劑、乳化劑、分散劑、防霜劑、殺生物劑、增稠劑及/或另外的輔助劑，例如佐劑之調配物或使用形式。在本文中佐劑為一種增強調配物之生物效應的組份，但組份本身不具有任何生物效應。佐劑之實例有促進停留、擴散性質、黏附葉面或滲透之試劑。

這些調配物係以已知的方法來製造，例如藉由將式(I)或式(I')之化合物與輔助劑，例如增量劑、溶劑及/或固體載劑及/或另外的佐劑，例如介面活性劑混合。調配物係在適合的設施中或另外在施用之前或施用期間所製備。

所用的輔助劑可為適用於將特定性質之物質，例如特定的物理、技術及/或生物性質，賦予式(I)或式(I')化合物之調配物或從這些調配物所製備

的使用形式(例如即用型除害劑，如噴霧液或種衣產品)。

適合的增量劑有，例如水、極性和非極性有機化學液體，例如來自芳香和非芳香烴類(例如石蠟、烷基苯、烷基萘、氯苯)，醇類和多醇類(其，若適當，亦可經取代、醚化及/或酯化)，酮類(例如丙酮、環己酮)，酯類(包括脂肪和油類)及(聚)醚類，未經取代和經取代胺類、醯胺類、內醯胺類(例如 N-烷基吡咯酮)和內酯，磺和亞磺(例如二甲基亞磺)。

若所用的增量劑為水，則亦可能使用，例如有機溶劑作為輔助溶劑。基本上適合的液體溶劑有：芳香系例如二甲苯、甲苯或烷基萘，氯化芳香系或氯化脂肪系烴類，例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷、脂肪系烴類例如環己烷或石蠟，例如礦物油餾份、礦物油和植物油，醇類例如丁醇或甘油及其醚類和酯類，酮類例如丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁基酮、或環己酮，強極性溶劑例如二甲基甲醯胺和二甲基亞磺以及水。

基本上，可能使用所有適合的溶劑。適合的溶劑之實例有芳香烴類，例如二甲苯、甲苯或烷基萘、氯化芳香系或脂肪系烴類，例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷、脂肪系烴類例如環己烷、石蠟、礦物油餾份、礦物油和植物油，醇類例如甲醇、乙醇、異丙醇、丁醇或甘油及其醚類和酯類，酮類例如丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁基酮或環己酮，強極性溶劑，例如二甲基亞磺以及水。

基本上可能使用所有適合的載劑。可用的載劑特別包括：例如銨鹽和天然細磨的岩石例如高嶺土、鋁氧土、滑石、白堊土、石英、鎂鋁海泡石、蒙特石或矽藻土，以及合成的細磨岩石，例如高分散矽石、氧化鋁和天然或合成的矽酸鹽、樹脂、蠟及/或固體肥料。同樣可使用此等載劑之混合物。可用於顆粒劑的載劑包括：例如粉碎和分級的天然岩石，例如方解石，大理石，浮石，海泡石，白雲石，和無機和有機粉末之合成顆粒，以及有

機材質例如木屑、紙、椰殼、玉米穗和煙草桿之顆粒。

亦可能使用液化氣體增量劑或溶劑。特別適合的增量劑或載劑有該等在標準溫度和大氣壓力下為氣體之增量劑或載劑，例如氣霧推進氣體，例如鹵化烴類以及丁烷、丙烷、氮和二氧化碳。

具有離子或非離子性質之乳化劑及/或成泡劑、分散劑或濕化劑或這些界面活性物質之混合物的實例有：聚丙烯酸的鹽類、木質磺酸的鹽類、酚磺酸或萘磺酸的鹽類、氧化乙烯與脂醇或與脂肪酸或與脂肪胺或與經取代酚類(較佳地烷基酚或芳基酚)的縮聚物，磺琥珀酯的鹽類、牛磺酸衍生物(較佳地烷基牛磺酸酯)、聚乙氧基醇或酚類的磷酯、多醇的脂肪酸酯及含有硫酸酯、磺酸酯和磷酸酯的化合物之衍生物，例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸酯、烷基硫酸酯、芳基磺酸酯、蛋白水解物、木質素亞硫酸鹽廢液及甲基纖維素。若其中一項式(I)或式(II)化合物及/或其中一種惰性載劑為不溶於水且當於水中進行施用時，則界面活性劑的存在為有利的。

可能存在調配物及從其衍生之使用形式中的另外輔助劑包括染劑，例如無機色料，例如氧化鐵、氧化鈦和普魯士藍，以及有機染劑例如茜素染劑、偶氮染劑和金屬酞菁染劑，以及營養素和微量營養素例如鐵、錳、硼、銅、鈷、鋁和鋅之鹽類。

可存在的另外組份有安定劑，例如低溫安定劑、防腐劑、抗氧化劑、光安定劑或其他改善化學及/或物理安定性之試劑。亦可存有成泡劑或消泡劑。

此外，調配物和從其衍生的使用形式亦可包括黏著劑例如羧甲基纖維素和天然及合成的粉狀、顆粒或膠乳形式之聚合物，例如阿拉伯膠、聚乙稀醇、聚乙烯乙酸酯，或其他天然的磷脂質例如腦磷脂和卵磷脂，以及合成的磷脂質，作為另外的輔助劑。另外的輔助劑可為礦物油和植物油。

若適當，在調配物及從其衍生的使用形式中仍存有另外的輔助劑為可能的。此等添加劑的實例有香精、保護膠體、結著劑、黏著劑、增稠劑、觸變劑、滲透劑、助留劑、安定劑、螯合劑、複合劑、保濕劑、擴散劑。一般而言，式(I)或式(I')化合物可與任何通常用於調配目的之固體或液體添加劑組合。

可用的助留劑包括所有該等降低動表面張力之物質，例如磺琥珀酸二辛酯，或增加黏彈性之物質，例如經丙基關華豆膠聚合物。

在本內文中有用的滲透劑為所有該等典型用於促進農化活性化合物滲透至植物中的物質。滲透劑在本內文中係以其從(一般為水性)施用液體及/或從噴霧層滲透至植物角質層並因此增加活性化合物在角質層中的移動之能力來定義。文獻中所述的方法(Baur 等人, 1997, *Pesticide Science* 51, 131-152)可用於測定此性質。實例包括醇烷氧基化物，例如椰脂乙氧基化物(10)或異十三基乙氧基化物(12)，脂肪酸酯例如菜籽油甲基酯或大豆油甲基酯，脂肪胺烷氧基化物，例如牛脂胺乙氧基化物(15)或銨鹽及/或磷鹽，例如硫酸銨或磷酸氫二銨。

調配物較佳地係包括，以調配物的重量為基準，介於 0.00000001%至 98%重量比的式(I)或式(I')化合物，更佳地，介於 0.01%至 95%重量比的式(I)或式(I')化合物，最佳地介於 0.5%至 90%重量比的式(I)或式(I')化合物。

從調配物所製備的使用形式中式(I)或式(I')化合物的含量可在廣泛的範圍中變化。使用形式中式(I)或式(I')化合物的濃度，以使用形式的重量為基準，典型地係介於 0.00000001%至 95%重量比的式(I)或式(I')化合物，較佳地介於 0.00001%至 1%重量比。施用係以適合使用形式之習用方式來進行。

混合物

式(I)或式(I')之化合物亦可以帶有一或多種適合的殺真菌劑、殺細菌劑、殺蟎劑、殺軟體動物劑、殺線蟲劑、殺昆蟲劑、微生物劑、天敵物種、除草劑、肥料、驅鳥劑、光子、殺菌劑、安全劑、化學信息素及/或植物生長調節劑之混合物來使用，以便於因此擴大作用效譜，延長作用效期、增加作用速率、防止排斥或防止抗藥性演化。此外，此類的活性成份組合可改善植物生長及/或對非生物因子，例如對高或低溫、對乾旱或對升高的水含量或土壤鹽分之耐受性。亦可能改善開花和結果的效能，最佳發芽能力及根部發育、幫助採收及改善產量、影響成熟度、改善收穫產物之品質及/或營養價值、延長保存期限及/或改善收穫產物之可加工性。

此外，式(I)或式(I')化合物可與其他活性成份或化學信息素，例如吸引劑及/或驅鳥劑及/或植物活化性及/或生長調節劑及/或肥料共同存在一混合物中。同樣地，式(I)或式(I')化合物可用於改善植物性質，例如，生長、產率和收穫物之品質。

在本發明一特別的實施例中，式(I)或式(I')化合物係與另外的化合物混合，較佳地該等如下列所述者，存在於調配物或從這些調配物所製備的使用形式中。

即使在各案例中未明確提出，但若下文所提及的化合物之一可發生不同的互變異構物形式，則亦包括這些形式。以其功能基為基準，若能夠的話，所有所提及的混合組份，視情況而定，亦可與適合的鹼或酸形成鹽類。

殺昆蟲劑/殺蟎劑/殺線蟲劑

以其通用名稱說明於文中之活性成份已為所知且係描述於，例如"The Pesticide Manual", 16th ed., British Crop Protection Council 2012 中，或可於網際網路上搜尋(例如 <http://www.alanwood.net/pesticides>)。此分類係以本專利申請書備案之時合用的 IRAC Mode of Action Classification Scheme

為基準。

(1) 乙醯膽鹼酯酶(AChE)抑制劑，例如胺甲酸酯類，例如阿納寧(alanycarb)、得滅克(aldicarb)、免敵克(bendiocarb)、免扶克(benfuracarb)、佈嘉信(butocarboxim)、佈斯嘉信(butoxycarboxim)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、丁基加保扶(carbosulfan)、愛殺芬卡(ethiofencarb)、丁基滅必蟲(fenobucarb)、覆滅蟎(formetanate)、呋線威(furathiocarb)、滅必蟲(isoprocarb)、滅賜克(methiocarb)、納乃得(methomyl)、治滅蟲(metolcarb)、歐殺滅(oxamyl)、抗蚜威(pirimicarb)、殘殺威(propoxur)、硫雙威(thiodicarb)、久效威(thiofanox)、啞蚜威(triazamate)、混滅威(trimethacarb)、XMC 及滅殺威(xylylcarb)；或有機磷酸酯類，例如歐殺松(acephate)、甲基吡啶磷(azamethiphos)、益棉磷(azinphos-ethyl)、穀速松(azinphos-methyl)、硫線磷(cadusafos)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、毒蟲畏(chlorfenvinphos)、氯甲硫磷(chlormephos)、甲基陶斯松(chlorpyrifos-methyl)、蠅毒磷(coumaphos)、殺螟腈(cyanophos)、滅賜松(demeton-S-methyl)、大利松(diazinon)、敵敵畏(dichlorvos)/DDVP、百治磷(dicrotophos)、大滅松(dimethoate)、二甲基毒蟲畏(dimethylvinphos)、乙拌磷(disulfoton)、EPN、乙硫磷(ethion)、滅線磷(ethoprophos)、伐滅磷(famphur)、苯線磷(fenamiphos)、殺螟硫磷(fenitrothion)、倍硫磷(fenthion)、噁唑磷(fosthiazate)、飛達松(heptenophos)、依米塞扶(imicyafos)、異柳磷(isofenphos)、異丙基 O-(甲氧基胺基硫基磷醯基)水楊酸酯、異噁唑磷(isoxathion)、馬拉硫磷(malathion)、滅蚜磷(mecarbam)、甲胺磷(methamidophos)、殺撲磷(methidathion)、速滅磷(mevinphos)、久效磷(monocrotophos)、二溴磷(naled)、氧樂果(omethoate)、亞砒磷(oxydemeton-methyl)、甲基對硫磷(parathion-methyl)、稻豐散(phenthoate)、甲拌磷(phorate)、伏殺硫磷(phosalone)、亞胺硫磷(phosmet)、

磷胺(phosphamidon)、胐硫磷(phoxim)、甲基嘧啶磷(pirimiphos-methyl)、丙溴磷(profenofos)、胺丙畏(propetamphos)、丙硫磷(prothiofos)、白克松(pyraclofos)、必芬松(pyridaphenthion)、拜裕松(quinalphos)、治螟磷(sulfotep)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、亞培松(temephos)、託福松(terbufos)、殺蟲畏(tetrachlorvinphos)、硫滅松(thiometon)、三唑磷(triazophos)、三氯松(trichlorfon)及繁米松(vamidothion)。

(2)GABA-閘控氯離子通道阻斷劑，例如環雙烯-有機氯類，例如可氯丹(chlordane)和安殺番(endosulfan)或苯基吡唑(菲普魯來斯(fiproles))，例如益斯普(ethiprole)和芬普尼(fipronil)。

(3)鈉通道調節劑，例如擬除蟲菊酯(pyrethroid)，例如氟丙菊酯(acrinathrin)、烯丙菊酯(allethrin)、d-順-反烯丙菊酯，d-反烯丙菊酯、畢芬寧(bifenthrin)、百亞列寧(bioallethrin)、百亞列寧-S-環戊烯基異構物、生物苧呋菊酯(bioresmethrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、β-賽扶寧、賽洛寧(cyhalothrin)、λ-賽洛寧、γ-賽洛寧、賽滅寧(cypermethrin)、α-賽滅寧、β-賽滅寧、θ-賽滅寧、ζ-賽滅寧、賽酚寧(cyphenothrin)[(1R)-反式異構物]、第滅寧(deltamethrin)、益避寧(empenthrin)[(EZ)-(1R)異構物]、益化利(esfenvalerate)、依芬寧(etofenprox)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、護賽寧(flucythrinate)、氟氯苯氰菊酯(flumethrin)、福化利(tau-fluvalinate)、合芬寧(halfenprox)、依普寧(imiprothrin)、克特寧(kadethrin)、momfluorothrin、百滅寧(permethrin)、苯醚菊酯(phenothrin)[(1R)-反式異構物]、炔丙菊酯(prallethrin)、除蟲菊素(pyrethrins)(除蟲菊 pyrethrum)、苧呋菊酯(resmethrin)、矽護芬(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin)、胺菊酯(tetramethrin)、胺菊酯[1R 異構物]、四溴菊酯(tralomethrin)及四氟苯菊酯(transfluthrin)或 DDT 或甲氧氯(methoxychlor)。

(4)尼古丁乙醯膽鹼受體(nAChR)競爭性調節劑，例如新菸鹼類，例如亞滅培(acetamiprid)、可尼丁(clothianidin)、達特南(dinotefuran)、益達胺(imidacloprid)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、噻蟲啉(thiacloprid)和噻蟲嗪(thiamethoxam)或菸鹼或氟啶蟲胺腈(sulfoxaflor)或氟吡呋喃酮(flupyradifurone)。

(5)尼古丁乙醯膽鹼受體(nAChR)之變構調節劑，例如多殺菌素(spinosyn)，例如賜拓侖(spinetoram)和賜諾殺(spinosad)。

(6)麩胺酸-閘控氯離子通道(GluCl)變構調節劑，例如，阿維菌素(ivermectin)/米貝菌素(milbemycin)，例如阿巴汀(abamectin)、因滅汀苯甲酸鹽(emamectin benzoate)、雷匹美汀(lepimectin)和密滅汀(milbemectin)。

(7)保幼激素模擬物，例如保幼激素類似物，例如烯蟲乙酯(hydroprene)、烯蟲炔酯(kinoprene)和美賜年(methoprene)或苯氧威(fenoxycarb)或蚊蟎醚(pyriproxyfen)。

(8)混雜非特定(多位置)抑制劑，例如烷基鹵化物，例如甲基溴和其他烷基鹵化物；或氯化苦(Chloropicrin)或硫醯氟(sulfuryl fluoride)或硼砂(borax)或吐酒石(tartar emetic)或異氰酸甲酯生成劑，例如邁隆(dazomet)和斯美地(metam)。

(9)弦音器官調節劑，例如派滅淨(pymetrozine)或氟尼胺(flonicamid)。

(10)蟎生長抑制劑，例如克芬蟎(clofentezine)、合賽多(hexythiazox)和敵氟淨(diflovidazin)或乙蟎唑(etoxazole)。

(11)昆蟲腸道膜微生物干擾劑，例如蘇力菌以色列亞種(*Bacillus thuringiensis* subspecies *israelensis*)、球形芽孢桿菌紡錘變種(*Bacillus sphaericus*)、蘇力菌鮎澤亞種(*Bacillus thuringiensis* subspecies *aizawai*)、蘇力菌庫爾斯塔克亞種(*Bacillus thuringiensis* subspecies *kurstaki*)、蘇力菌粉

蟲亞種(*Bacillus thuringiensis* subspecies *tenebrionis*)，及 *B.t.*植物蛋白質：
Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、VIP3A、mCry3A、Cry3Ab、
Cry3Bb、Cry34Ab1/35Ab1。

(12)粒線體 ATP 合成酶之抑制劑，例如 ATP 干擾劑，例如汰芬隆
(diafenthiuron)或有機錫化合物，例如亞環錫(azocyclotin)、錫蟎丹(cyhexatin)
及芬布賜(fenbutatin oxide)或毆蟎多(Propargite)或得脫蟎(Tetradifon)。

(13)經由擾亂質子梯度作用之氧化磷酸化去偶合劑，例如蟲蟎腈
(chlorfenapyr)、DNOC 和沙氟米得(sulfluramid)。

(14)尼古丁乙醯膽鹼受體通道阻斷劑，例如免速達(bensultap)、培丹鹽
酸鹽(cartap hydrochloride)、硫賜安(thiocyclam)和殺蟲單
(thiosultap-sodium)。

(15)甲殼素生物合成抑制劑，第 0 型，例如雙三氟蟲脲(bistrifluron)、
克福隆(chlofluzuron)、二福隆(diflubenzuron)、氟環脲(flucycloxuron)、氟
芬隆(flufenoxuron)、六伏隆(hexaflumuron)、祿芬隆(lufenuron)、諾瓦隆
(novaluron)、紐伏隆(noviflumuron)、得福隆(teflubenzuron)及殺蟲隆
(triflumuron)。

(16)甲殼素生物合成抑制劑，第 1 型，例如布芬淨(buprofezin)。

(17)蛻皮干擾劑(特別是雙翅目之情況)，例如賽滅淨(Cyromazine)。

(18)蛻皮素受體促效劑，例如環蟲醯肼(chromafenozide)、氯蟲醯肼
(halofenozide)、甲氧蟲醯肼(methoxyfenozide)及蟲醯肼(tebufenozide)。

(19)奧克巴胺(octopamine)受體促效劑，例如三亞蟎(amitraz)。

(20)粒線體複合物 III 電子傳遞抑制劑，例如伏蟎脘(hydramethylnon)
或亞醯蟎(acequinocyl)或啞蟎酯(fluacrypyrim)。

(21)粒線體複合物 I 電子傳遞抑制劑，例如來自 METI 殺蟎劑，例如

啞蟎醑(fenazaquin)、芬普蟎(fenpyroximate)、畢汰芬(pyrimidifen)、啞蟎靈(pyridaben)、吡蟎胺(tebufenpyrad)和啞蟲醑胺(tolfenpyrad)或魚藤酮(rotenone)(Derris)。

(22)電壓-依賴的鈉通道阻斷劑，例如茛蟲威(indoxacarb)或美氟脞(metaflumizon)。

(23)乙醑基-CoA 羧基酶之抑制劑，例如特窗酸(tetronic acid)和特拉姆酸(tetramic acid)衍生物，例如螺蟎酯(spirodiclofen)、螺甲蟎酯(spiromesifen)及螺泰曲美(spirotetramate)。

(24)粒線體複合物 IV 電子傳遞抑制劑，例如磷類，例如磷化鋁、磷化鈣，磷和磷化鋅或氰化物、氰化鈣、氰化鉀和氰化鈉。

(25)粒線體複合物 II 電子傳遞抑制劑，例如 β -酮腓衍生物，例如賽諾吩(cyenopyrafen)和賽芬蟎(Cyflumetofen)，和甲醑苯胺類，例如pyflubumide。

(28)雷若丁(Ryanodine)受體調節劑，例如二醑胺類，例如剋安勃(chlorantraniliprole)、氰蟲醑胺(Cyantraniliprole)和氟蟲醑胺(flubendiamide)，

另外的活性成份，例如 afidopyropen、阿弗索拉納(afoxolaner)、印棟素(azadirachtin)、苯克噠(benclothiaz)、苯蟎特(benzoximate)、聯苯肼酯(bifenazate)、broflanilide、溴蟎酯(bromopropylate)、滅蟎猛(chinomethionat)、右旋反式氯丙炔菊酯(chloroprallethrin)、冰晶石(cryolite)、環溴蟲醑胺(cyclaniliprole)、環氧蟲啉(cycloxaprid)、cyhalodiamide、dicloromezotiaz、大克蟎(dicofol)、 ϵ -甲氧苄氟菊酯(epsilon metofluthrin)、甲氧苄氟菊酯單體(epsilon momfluthrin)、flometoquin、三氟咪啉醑胺(fluzaindolizine)、氟噠蟲磺(flusulfone)、嘧蟲胺(flufenerim)、氟菌蟎酯(flufenoxystrobin)、丁蟲

臆(fluiprole)、fluhexafon、氟批菌醯胺(fluopyram)、fluralaner、fluxametamide、
 呋喃蟲醯肼(fufenozide)、guadipyr、氯氟醚菊酯(heptafluthrin)、氯噁啉
 (imidaclothiz)、依普同(Iprodione)、κ-畢芬寧(kappa-bifenthrin)、κ-七氟菊
 酯(kappa-tefluthrin)、lotilaner、氟醚菊酯(meperfluthrin)、呱蟲啉
 (paichongding)、三氟甲吡醚(pyridalyl)、pyrifluquinazon、嘧蟻胺
 (pyriminostrobin)、賜派芬(spirobudiclofen)、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)、
 tetraniliprole、剋安勃(tetrachlorantraniliprole)、tioxazafen、thiofluoximate、
 三氟苯嘧啶(triflumezopyrim)和碘甲烷(methyl iodide)；此外以堅強芽胞桿
 菌為基礎的製備物(I-1582、BioNeem、Votivo)，及下列化合物：1-{2-氟-4-
 甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亞磺醯基]苯基}-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺
 (得自 WO2006/043635)(CAS 885026-50-6)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯
 -1-基]-5-氟螺[吡啶-3,4'-哌啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮(得自
 WO2003/106457)(CAS 637360-23-7)、2-氯-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-
 烯-1-基]哌啶-4-基}-4-(三氟甲基)苯基]異菸鹼醯胺(得自
 WO2006/003494)(CAS 872999-66-1)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-4-羥基-8-甲
 氧基-1,8-二氮螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(得自 WO 2010052161)(CAS
 1225292-17-0)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-側氧-1,8-二氮螺[4.5]
 癸-3-烯-4-基乙基碳酸酯(得自 EP 2647626)(CAS-1440516-42-6)、4-(丁-2-
 炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基哌啶-1-基)-5-氟嘧啶(得自 WO2004/099160)
 (CAS 792914-58-0)、PF1364(得自 JP2010/018586)(CAS Reg.No.
 1204776-60-2)、N-[(2E)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]吡啶-2(1H)-亞基]-2,2,2-三
 氟乙醯胺(得自 WO2012/029672)(CAS 1363400-41-2)、(3E)-3-[1-[(6-氯-3-
 吡啶基)甲基]-2-伸二氮吡啶基]-1,1,1-三氟丙-2-酮(得自 WO2013/144213)
 (CAS 1461743-15-6)、N-[3-(苯甲基胺甲醯基)-4-氯苯基]-1-甲基-3-(五氟乙

基)-4-(三氟甲基)-1H-吡啶-5-甲酰胺(得自 WO2010/051926)(CAS 1226889-14-0)、5-溴-4-氯-N-[4-氯-2-甲基-6-(甲基胺甲酰基)苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)吡啶-3-甲酰胺(得自 CN103232431)(CAS 1449220-44-3)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-2-甲基-N-(順-1-氧化-3-噻唑基)苯甲酰胺、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-2-甲基-N-(反-1-氧化-3-噻唑基)苯甲酰胺及 4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-2-甲基-N-(順-1-氧化-3-噻唑基)苯甲酰胺(得自 WO 2013/050317 A1)(CAS 1332628-83-7)、N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡啶-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亞磺酰基]丙酰胺、(+)-N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡啶-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亞磺酰基]丙酰胺及(-)-N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡啶-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亞磺酰基]丙酰胺(得自 WO 2013/162715 A2、WO 2013/162716 A2、US 2014/0213448 A1)(CAS 1477923-37-7)、5-[(2E)-3-氯-2-丙烯-1-基]胺基-1-[2,6-二氯-4-(三氟甲基)苯基]-4-[(三氟甲基)亞磺酰基]-1H-吡啶-3-甲腈(得自 CN 101337937 A)(CAS 1105672-77-2)、3-溴-N-[4-氯-2-甲基-6-[(甲基胺基)硫醚氧甲基]苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡啶-5-甲酰胺、(Liudaibenjiaxuanan, 得自 CN 103109816 A)(CAS 1232543-85-9)；N-[4-氯-2-[(1,1-二甲基乙基)胺基]羰基]-6-甲基苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(氟甲氧基)-1H-吡啶-5-甲酰胺(得自 WO 2012/034403 A1)(CAS 1268277-22-0)、N-[2-(5-胺基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡啶-5-甲酰胺(得自 WO 2011/085575 A1)(CAS 1233882-22-8)、4-[3-[2,6-二氯-4-[(3,3-二氯-2-丙烯-1-基)氧基]苯氧基]丙氧基]-2-甲氧基-6-(三氟甲基)嘧啶(得自 CN 101337940 A)(CAS 1108184-52-6)；(2E)-及 2(Z)-2-[2-(4-氟基苯基)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亞乙基]-N-[4-(二氟甲氧基)苯

基]肼基甲醯胺(得自 CN 101715774 A)(CAS 1232543-85-9)；環丙羧酸 3-(2,2-二氯乙基)-2,2-二甲基-4-(1H-苯并咪唑-2-基)苯基酯(得自 CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4)；(4aS)-7-氯-2,5-二氫-2-[(甲氧基羰基)[4-[(三氟甲基)硫基]苯基]胺基]羰基]茚并[1,2-e][1,3,4]喹二吡-4a(3H)-羧酸甲酯(得自 CN 102391261 A)(CAS 1370358-69-2)；6-去氧-3-O-乙基-2,4-二-O-甲基-1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-五氟乙氧基)苯基]-1H-1,2,4-三唑-3-基]苯基]胺甲酸]- α -L-吡喃甘露糖(得自 US 2014/0275503 A1)(CAS 1181213-14-8)；8-(2-環丙基甲氧基-4-三氟甲基苯氧基)-3-(6-三氟甲基嗒吡-3-基)-3-氮雜二環[3.2.1]辛烷(CAS 1253850-56-4)、(8-逆)-8-(2-環丙基甲氧基-4-三氟甲基苯氧基)-3-(6-三氟甲基嗒吡-3-基)-3-氮雜二環[3.2.1]辛烷(CAS 933798-27-7)、(8-同)-8-(2-環丙基甲氧基-4-三氟甲基苯氧基)-3-(6-三氟甲基嗒吡-3-基)-3-氮雜二環[3.2.1]辛烷(得自 WO 2007040280 A1、WO 2007040282 A1)(CAS 934001-66-8)及 N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)硫基]丙醯胺(得自 WO 2015/058021 A1、WO 2015/058028 A1)(CAS 1477919-27-9)。

殺真菌劑

以其「通用名稱」說明於文中之活性成份已為所知且係描述於，例如 "Pesticide Manual"(16th ed., British Crop Protection Council)，或可於網際網路上搜尋(例如 <http://www.alanwood.net/pesticides>)。

在(1)至(15)類中所提及的所有混合組份，視情況而定，若能夠的話，以其功能基為基準，可與適合的鹼或酸形成鹽類。在(1)至(15)類中所提及的所有殺真菌混合組份，視情況而定，可包括互變異構物形式。

1)麥角固醇生物合成抑制劑，例如(1.001)環唑醇(cyproconazole)、(1.002)待普克利(difenoconazole)、(1.003)氟環唑(epoxiconazole)、(1.004)

環酸菌胺(fenhexamid)、(1.005) 苯銹啉(fenpropidin)、(1.006)丁苯嗎啉(fenpropimorph)、(1.007)胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)、(1.008)氟喹唑(fluquinconazole)、(1.009)粉唑醇(flutriafol)、(1.010)抑黴唑(imazalil)、(1.011)烯菌靈(imazalil sulphate)、(1.012)種菌唑(ipconazole)、(1.013)葉菌唑(metconazole)、(1.014)腈菌唑(myclobutanil)、(1.015)多效唑(paclobutrazol)、(1.016)咪鮮胺(prochloraz)、(1.017)丙環唑(propiconazole)、(1.018)丙硫菌唑(prothioconazole)、(1.019)氯啉菌酯(pyrisoxazole)、(1.020)螺環菌胺(spiroxamine)、(1.021)戊唑醇(tebuconazole)、(1.022)四氟醚唑(tetraconazole)、(1.023)三唑醇(triadimenol)、(1.024)十三嗎啉(tridemorph)、(1.025)氟菌唑(triflumizole)、(1.026)(1R,2S,5S)-5-(4-氯苯甲基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)環戊醇、(1.027)(1S,2R,5R)-5-(4-氯苯甲基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)環戊醇、(1.028)(2R)-2-(1-氯環丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯環丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇 (1.029)(2R)-2-(1-氯環丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯環丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.030)(2R)-2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.031)(2S)-2-(1-氯環丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯環丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.032)(2S)-2-(1-氯環丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯環丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.033)(2S)-2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.034)(R)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.035)(S)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.036)[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.037)1-({(2R,4S)-2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-4-甲基-1,3-二氧戊環-2-基}甲基)-1H-1,2,4-三唑、(1.038)1-({(2S,4S)-2-[2-氯

-4-(4-氯苯氧基)苯基]-4-甲基-1,3-二氧戊環-2-基}甲基)-1H-1,2,4-三唑、
 (1.039)1-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三
 唑-5-基硫氰酸酯、(1.040)1-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧
 乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.041)1-{[rel(2R,3S)-3-(2-
 氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸
 酯、(1.042)2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-
 基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.043)2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯
 基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、
 (1.044)2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二
 氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.045)2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基
 -2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、
 (1.046)2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二
 氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.047)2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基
 -2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、
 (1.048)2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二
 氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.049)2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基
 -2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.050)2-[1-(2,4-二
 氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、
 (1.051)2-[2-氯-4-(2,4-二氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、
 (1.052)2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、
 (1.053)2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、
 (1.054)2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)戊-2-醇、
 (1.055)2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、
 (1.056)2-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氫

-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.057)2- $\{[\text{rel}(2R,3R)\text{-}3\text{-(2-氯苯基)-}2\text{-(2,4-二氟苯基)}]$ 環氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、
 (1.058)2- $\{[\text{rel}(2R,3S)\text{-}3\text{-(2-氯苯基)-}2\text{-(2,4-二氟苯基)}]$ 環氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.059)5-(4-氯苯甲基)-2-(氯甲基)-2-
 甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)環戊醇、(1.060)5-(烯丙基氫硫
 基)-1- $\{[3\text{-(2-氯苯基)-}2\text{-(2,4-二氟苯基)}]$ 環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、
 (1.061)5-(烯丙基氫硫基)-1- $\{[\text{rel}(2R,3R)\text{-}3\text{-(2-氯苯基)-}2\text{-(2,4-二氟苯基)}]$ 環
 氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(1.062)5-(烯丙基氫硫
 基)-1- $\{[\text{rel}(2R,3S)\text{-}3\text{-(2-氯苯基)-}2\text{-(2,4-二氟苯基)}]$ 環氧乙烷-2-基]甲
 基}-1H-1,2,4-三唑、(1.063)N'-(2,5-二甲基-4- $\{[3\text{-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基}]$
 氫硫基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲脒、(1.064)N'-(2,5-二甲基
 -4- $\{[3\text{-(2,2,2-三氟乙氧基)苯基}]$ 氫硫基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲脒、
 (1.065)N'-(2,5-二甲基-4- $\{[3\text{-(2,2,3,3-四氟丙氧基)苯基}]$ 氫硫基}苯基)-N-乙
 基-N-甲基亞胺基甲脒、(1.066)N'-(2,5-二甲基-4- $\{[3\text{-(五氟乙氧基)苯基}]$ 氫
 硫基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲脒、(1.067)N'-(2,5-二甲基
 -4- $\{3\text{-}[(1,1,2,2\text{-四氟乙基})\text{氫硫基}]$ 苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲脒、
 (1.068)N'-(2,5-二甲基-4- $\{3\text{-}[(2,2,2\text{-三氟乙基})\text{氫硫基}]$ 苯氧基}苯基)-N-乙基
 -N-甲基亞胺基甲脒、(1.069)N'-(2,5-二甲基-4- $\{3\text{-}[(2,2,3,3\text{-四氟丙基})\text{氫硫基}]$
 苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲脒、(1.070)N'-(2,5-二甲基-4- $\{3\text{-}[(五$
 氟乙基)氫硫基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲脒、(1.071)N'-(2,5-
 二甲基-4-苯氧基苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲脒、(1.072)N'-(4- $\{[3\text{-(二氟$
 甲氧基)苯基}]氫硫基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲脒、
 (1.073)N'-(4- $\{3\text{-}[(二氟甲基)\text{氫硫基}]$ 苯氧基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲
 基亞胺基甲脒、(1.074)N'-[5-溴-6-(2,3-二氫-1H-茚-2-基氧基)-2-甲基吡啶-3-

基]-N-乙基-N-甲基亞胺基甲脒、(1.075)N'-{4-[(4,5-二氯-1,3-噻唑-2-基)氧基]-2,5-二甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲脒、(1.076)N'-{5-溴-6-[(1R)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲脒、(1.077)N'-{5-溴-6-[(1S)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲脒、(1.078)N'-{5-溴-6-[(順-4-異丙基環己基)氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲脒、(1.079)N'-{5-溴-6-[(反-4-異丙基環己基)氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲脒、(1.080)N'-{5-溴-6-[1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲脒。

2)複合物 I 或 II 中之呼吸鏈抑制劑，例如(2.001)苯并烯氟菌唑(benzovindiflupyr)、(2.002)異噻菌胺(bixafen)、(2.003)啞醯菌胺(boscalid)、(2.004)萎鏽靈(carboxin)、(2.005)氟吡菌醯胺(fluopyram)、(2.006)氟醯胺(flutolanil)、(2.007)氟唑菌醯胺(fluxapyroxad)、(2.008)福拉比(furametpyr)、(2.009)isofetamid、(2.010)亞派占(isopyrazam)(逆-表異構鏡像異構物 1R、4S、9S)、(2.011)亞派占(isopyrazam)(逆-表異構鏡像異構物 1S、4R、9R)、(2.012)亞派占(isopyrazam)(逆-表異構外消旋物 1RS、4SR、9SR)、(2.013)亞派占(isopyrazam)(同-表異構外消旋物 1RS、4SR、9RS 和逆-表異構外消旋物 1RS、4SR、9SR 之混合物)、(2.014)亞派占(isopyrazam)(同-表異構鏡像異構物 1R、4S、9R)、(2.015)亞派占(isopyrazam)(同-表異構鏡像異構物 1S、4R、9S)、(2.016)亞派占(isopyrazam)(同-表異構外消旋物 1RS、4SR、9RS)、(2.017)戊苯吡菌胺(penflufen)、(2.018)吡噻菌胺(penthiopyrad)、(2.019)pydiflumetofen、(2.020)pyraziflumid、(2.021)環丙吡菌胺(sedaxane)、(2.022)1,3-二甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基)-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.023)1,3-二甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基]-1H-吡唑

-4-甲醯胺、(2.024)1,3-二甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.025)1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[2'-(三氟甲基)聯苯-2-基]-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.026)2-氟-6-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)苯甲醯胺、(2.027)3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.028)3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.029)3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.030)3-(二氟甲基)-N-(7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.031)3-(二氟甲基)-N-[(3R)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.032)3-(二氟甲基)-N-[(3S)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.033)5,8-二氟-N-[2-(2-氟-4-{[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]氧基}苯基)乙基]喹啉-4-胺、(2.034)N-(2-環戊基-5-氟苯基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.035)N-(2-第三丁基-5-甲基苯基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.036)N-(2-第三丁基苯基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.037)N-(5-氯-2-乙基苯基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.038)N-(5-氯-2-異丙基苯基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.039)N-[(1R,4S)-9-(二氯伸甲基)-1,2,3,4-四氫-1,4-甲酮萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.040)N-[(1S,4R)-9-(二氯伸甲基)-1,2,3,4-四氫-1,4-甲酮萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.041)N-[1-(2,4-二氯苯基)-1-甲氧基丙-2-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.042)N-[2-氯-6-(三氟甲基)苯基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、

(2.043)N-[3-氯-2-氟-6-(三氟甲基)苯甲基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.044)N-[5-氯-2-(三氟甲基)苯甲基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.045)N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-N-[5-甲基-2-(三氟甲基)苯甲基]-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.046)N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-氟-6-異丙基苯甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.047)N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-異丙基-5-甲基苯甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.048)N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-異丙基苯甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-硫代甲醯胺、(2.049)N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-異丙基苯甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.050)N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(5-氟-2-異丙基苯甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.051)N-環丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-4,5-二甲基苯甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.052)N-環丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-氟苯甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.053)N-環丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-甲基苯甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.054)N-環丙基-N-(2-環丙基-5-氟苯甲基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.055)N-環丙基-N-(2-環丙基-5-甲基苯甲基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.056)N-環丙基-N-(2-環丙基苯甲基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺。

3)複合物 III 之呼吸鏈抑制劑，例如(3.001)辛唑嘧菌胺(ametocetradin)、(3.002)呋唑磺菌(amisulbrom)、(3.003)嘧菌酯(azoxystrobin)、(3.004)甲香菌酯(coumethoxystrobin)、(3.005)丁香菌酯(coumoxystrobin)、(3.006)賽座滅(cyazofamid)、(3.007)醚菌胺(dimoxystrobin)、(3.008)亞托敏(enoxastrobin)、(3.009)噁唑菌酮(famoxadone)、(3.010)咪唑菌酮(fenamidone)、(3.011)氟菌蟎酯(flufenoxystrobin)、(3.012)氟嘧菌酯(fluxastrobin)、(3.013)醚菌酯

(kresoxim-methyl)、(3.014) 苯氧菌 (metominostrobin)、(3.015) 肟醚菌胺 (orysastrobin)、(3.016) 啉氧菌酯 (picoxystrobin)、(3.017) 唑菌胺酯 (pyraclostrobin)、(3.018) 唑胺菌酯 (pyrametostrobin)、(3.019) 唑菌酯 (pyraoxystrobin)、(3.020) 肟菌酯 (trifloxystrobin)、(3.021)(2E)-2-{2-[[[(1E)-1-(3-{[(E)-1-氟-2-苯基乙烯基]氧基}苯基)亞乙基]胺基]氧基]甲基]苯基}-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基乙醯胺、(3.022)(2E,3Z)-5-{[1-(4-氯苯基)-1H-吡唑-3-基]氧基}-2-(甲氧基亞胺基)-N,3-二甲基戊-3-烯醯胺、(3.023)(2R)-2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙醯胺、(3.024)(2S)-2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙醯胺、(3.025)(3S,6S,7R,8R)-8-苯甲基-3-[(3-{[(異丁醯基氧基)甲氧基]-4-甲氧基吡啶-2-基}羰基)胺基]-6-甲基-4,9-二側氧-1,5-二氧戊環-7-基 2-甲基丙酸酯、(3.026)2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙醯胺、(3.027)N-(3-乙基-3,5,5-三甲基環己基)-3-甲醯胺基-2-羥基苯甲醯胺、(3.028)(2E,3Z)-5-{[1-(4-氯-2-氟苯基)-1H-吡唑-3-基]氧基}-2-(甲氧基亞胺基)-N,3-二甲基戊-3-烯醯胺。

4)有絲分裂和細胞分裂抑制劑，例如(4.001)多菌靈(carbendazim)、(4.002)乙黴威(diethofencarb)、(4.003)噻唑菌胺(ethaboxam)、(4.004)氟吡菌胺(fluopicolide)、(4.005)戊菌隆(pencycuron)、(4.006)噻菌靈(thiabendazole)、(4.007)甲基硫菌靈(thiophanate-methyl)、(4.008)硫菌靈(zoxamide)、(4.009)3-氯-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基-5-苯基嗒吡、(4.010)3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基嗒吡、(4.011)3-氯-5-(6-氯吡啶-3-基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)嗒吡、(4.012)4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.013)4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.014)4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、

(4.015)4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、
 (4.016)4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、
 (4.017)4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、
 (4.018)4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、
 (4.019)4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、
 (4.020)4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、
 (4.021)4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、
 (4.022)4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基嗒吡、(4.023)N-(2-溴-6-氟
 苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.024)N-(2-溴苯
 基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.025)N-(4-氯-2,6-二氟苯
 基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺。

5)具有多位點活性能力之化合物，例如(5.001)波爾多液(bordeaux mixture)、(5.002)敵菌丹(captafol)、(5.003)克菌丹(captan)、(5.004)百菌清(chlorothalonil)、(5.005)氫氧化銅、(5.006)環烷酸銅、(5.007)氧化銅、(5.008)氧氯化銅、(5.009)硫酸銅(2+)、(5.010)腈硫醯(dithianon)、(5.011)多果定(dodine)、(5.012)福爾培(folpet)、(5.013)代森錳鋅(mancozeb)、(5.014)代森猛(maneb)、(5.015)免得爛(metiram)、(5.016)免得爛鋅(metiram zinc)、(5.017)喹啉銅(copper oxine)、(5.018)丙森鋅(propineb)、(5.019)硫和硫製備物包括多硫化鈣、(5.020)福美雙(thiram)、(5.021)代森鋅(zineb)、(5.022)福美鋅(ziram)。

6)能觸發宿主防禦之化合物，例如(6.001)阿拉酸式苯-S-甲基(acibenzolar-S-methyl)、(6.002)異噻菌胺(isotianil)、(6.003)稀丙苯噁唑(probenazole)、(6.004)噻醯菌胺(tiadinil)。

7)胺基酸及/或蛋白質生物合成抑制劑，例如(7.001)嘧菌環胺

(cyprodinil)、(7.002)春雷黴素(kasugamycin)、(7.003)春雷黴素鹽酸鹽水合物、(7.004)土黴素(oxytetracycline)、(7.005)嘧黴胺(pyrimethanil)、(7.006)3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)喹啉。

(8)ATP 生產抑制劑，例如(8.001)矽噻菌胺(silthiofam)。

9)細胞壁合成抑制劑，例如(9.001)苯噻菌胺(benthiavalicarb)、(9.002)烯醯嗎啉(dimethomorph)、(9.003)氟嗎啉(flumorph)、(9.004)異丙菌胺(iprovalicarb)、(9.005)雙炔酸菌胺(mandipropamid)、(9.006)丁吡嗎啉(pyrimorph)、(9.007)valifenalate、(9.008)(2E)-3-(4-第三丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(嗎福啉-4-基)丙-2-烯-1-酮、(9.009)(2Z)-3-(4-第三丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(嗎福啉-4-基)丙-2-烯-1-酮。

10)脂質和膜合成抑制劑，例如(10.001)霜黴威(propamocarb)、(10.002)霜黴威鹽酸鹽、(10.003)甲基立枯磷(tolclofos-methyl)。

11)黑色素生物合成抑制劑，例如(11.001)三環唑(tricyclazole)、(11.002)2,2,2-三氟乙基{3-甲基-1-[(4-甲基苯甲醯基)胺基]丁-2-基}胺甲酸酯。

12)核酸合成抑制劑，例如(12.001)苯霜靈(benalaxyl)、(12.002)精苯霜靈((benalaxyl-M (kiralaxyl))、(12.003)甲霜靈(metalaxyl)、(12.004)高效甲霜靈(metalaxyl-M (mefenoxam))。

13)信號轉導抑制劑，例如(13.001)護汰寧(fludioxonil)、(13.002)依普同(iprodione)、(13.003)腐黴利(procymidone)、(13.004)丙氧喹啉(proquinazid)、(13.005)苯氧喹啉(quinoxifen)、(13.006)乙烯菌核利(vinclozolin)。

14)可用作為去偶合劑之化合物，例如(14.001)氟啶胺(fluzinam)、(14.002)甲基敵蟎普(meptyldinocap)。

15)另外的化合物，例如(15.001)離層酸(abscisic acid)、(15.002)苯噻硫

氰(benthiazole)、(15.003)bethoxazin、(15.004)卡巴西黴素(capsimycin)、
 (15.005)香旱芹酮(carvone)、(15.006)滅蟊猛(chinomethionat)、(15.007)硫雜
 靈(cufraneb)、(15.008)環氟菌胺(cyflufenamid)、(15.009)霜服氰(cymoxanil)、
 (15.010)啖醯菌胺(cyprosulfamide)、(15.011)flutianil、(15.012)三乙膦酸鋁
 (fosetyl-aluminium)、(15.013)三乙膦酸鈣(fosetyl-calcium)、(15.014)三乙膦
 酸鈉(fosetyl-sodium)、(15.015)異硫氰酸甲酯(methyl isothiocyanate)、(15.016)
 苯菌酮(metrafenone)、(15.017)米多黴素(mildiomycin)、(15.018)多馬黴素
 (natamycin)、(15.019)二硫代胺基甲酸鎳(nickel dimethyl dithiocarbamate)、
 (15.020) 酞 菌 酯 (nitrothal-Isopropyl)、(15.021) 草 胺 威 (oxamocarb)、
 (15.022)oxathiapiprolin、(15.023)氧芬辛(oxyfenthiin)、(15.024)五氯酚
 (pentachlorophenol)及其鹽類、(15.025)膦酸及其鹽類、(15.026)膦酸霜黴威
 (propamocarb-fosetylate)、(15.027)pyrifenone (chlazafenone)、(15.028)異丁
 乙氧喹啉(tebufloquin)、(15.029)葉枯酞(tecloftalam)、(15.030)tolnifanide、
 (15.031)1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑
 -2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、
 (15.032)1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-
 基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(15.033)2-(6-
 苯甲基吡啶-2-基)噻唑啉、(15.034)2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二硫雜己環并
 [2,3-c:5,6-c']二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮、(15.035)2-[3,5-雙(二氟甲基)-1H-
 吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-
 基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.036)2-[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑
 -1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-
 基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.037)2-[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑
 -1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-

基}-1,3-噻唑-2-基)吡啶-1-基]乙酮、(15.038)2-[6-(3-氟-4-甲氧基苯基)-5-甲基吡啶-2-基]噻唑啉、(15.039)2-[(5R)-3-[2-(1-{[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基}吡啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-5-基}-3-氯苯基甲磺酸酯、(15.040)2-[(5S)-3-[2-(1-{[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基}吡啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-5-基}-3-氯苯基甲磺酸酯、(15.041)2-{2-[(7,8-二氟-2-甲基噻啉-3-基)氧基]-6-氟苯基}丙-2-醇、(15.042)2-{2-氟-6-[(8-氟-2-甲基噻啉-3-基)氧基]苯基}丙-2-醇、(15.043)2-{3-[2-(1-{[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基}吡啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-5-基}-3-氯苯基甲磺酸酯、(15.044)2-{3-[2-(1-{[3,5-雙(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基}吡啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氫-1,2-噁唑-5-基}苯基甲磺酸酯、(15.045)2-苯基酚及其鹽類、(15.046)3-(4,4,5-三氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異噻啉-1-基)噻啉、(15.047)3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異噻啉-1-基)噻啉、(15.048)4-胺基-5-氟嘧啶-2-醇(互變異構物形式：4-胺基-5-氟嘧啶-2(1H)-酮)、(15.049)4-側氧-4-[(2-苯基乙基)胺基]丁酸、(15.050)5-胺基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇、(15.051)5-氯-N'-苯基-N'-(丙-2-炔-1-基)噻吩 2-苯磺醯肼、(15.052)5-氟-2-[(4-氟苯基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.053)5-氟-2-[(4-甲基苯基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.054)9-氟-2,2-二甲基-5-(噻啉-3-基)-2,3-二氫-1,4-苯并氮呋、(15.055)丁-3-炔-1-基{6-[(Z)-(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)伸甲基]胺基}氧基]甲基]吡啶-2-基}胺甲酸酯、(15.056)(2Z)-3-胺基-2-氰基-3-苯基丙烯酸乙酯、(15.057)啡啉-1-羧酸、(15.058)3,4,5-三羥基苯甲酸丙酯、(15.059)噻啉-8-醇、(15.060)噻啉-8-醇硫酸酯(2:1)、(15.061){6-[(Z)-(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)伸甲基]胺基}氧基]甲基]吡啶-2-基}胺甲酸第三丁基酯。

生物性除害劑作為混合組份

式(I)或式(I')化合物可與生物性除害劑組合。

生物性除害劑特別是包括細菌、真菌、酵母菌、植物萃取物和由微生物所形成的產物，包括蛋白和二級代謝物。

生物性除害劑係包括細菌，例如產孢子細菌、根拓殖化細菌及作為生物性殺昆蟲劑、殺真菌劑或殺線蟲劑之細菌。

此等所使用或可用作生物性除害劑之細菌的實例有：

液化澱粉芽孢桿菌(*Bacillus amyloliquefaciens*)，FZB42 菌株(DSM 231179)或仙人掌桿菌(*Bacillus cereus*)，特別是仙人掌桿菌 CNCM I-1562 菌株或強固芽孢桿菌(*Bacillus firmus*)I-1582 菌株(登錄號 CNCM I-1582)或短小芽孢桿菌(*Bacillus pumilus*)，特別是 GB34 菌株(登錄號 ATCC 700814)及 QST2808 菌株(登錄號 NRRL B-30087))或枯草芽孢桿菌(*Bacillus subtilis*)，特別是 GB03 菌株(登錄號 ATCC SD-1397)或枯草芽孢桿菌 QST713 菌株(登錄號 NRRL B-21661)或枯草芽孢桿菌 OST 30002 菌株(登錄號 NRRL B-50421)，蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)，特別是蘇力菌以色列亞種(*B. thuringiensis* subspecies *israelensis*)(血清型 H-14) AM65-52 菌株(登錄號 ATCC 1276)或蘇力菌鮎澤亞種(*B. thuringiensis* subsp. *aizawai*)，特別是 ABTS-1857 菌株(SD-1372)或蘇力菌庫爾斯塔克亞種(*B. thuringiensis* subsp. *kurstaki*) HD-1 菌株或蘇力菌粉蟲亞種(*B. thuringiensis* subsp. *tenebrionis*)NB 176 菌株(SD-5428)，穿刺巴氏桿菌(*Pasteuria penetrans*)，巴斯德桿菌屬(*Pasteuria* spp.)(腎形線蟲(*Rotylenchulus reniformis*))-PR3 (登錄號 TCC SD-5834)，細黃鏈黴菌(*Streptomyces microflavus*) AQ6121 菌株(= QRD 31.013、NRRL B-50550)，鮮黃鏈黴菌(*Streptomyces galbus*)AQ 6047 菌株(登錄號 NRRL 30232)。

所使用或可用作生物性除害劑之真菌和酵母菌之實例有：

本土白殭菌(*Beauveria bassiana*)，特別是 ATCC 74040 菌株，微坦盾殼黴(*Coniothyrium minitans*)，特別是 CON/M/91-8 菌株(登錄號 DSM-9660)，輪枝菌(*Lecanicillium spp.*)，特別是 HRO LEC 12 菌株，蠟蚧輪枝菌(*Lecanicillium lecanii*)(以前稱為 *Verticillium lecanii*)，特別是 KV01 菌株，黑殭菌(*Metarhizium anisopliae*)，特別是 F52 菌株(DSM3884/ ATCC 90448)，梅氏酵母(*Metschnikowia fructicola*)，特別是 NRRL Y-30752 菌株，玫煙色擬青黴(*Paecilomyces fumosoroseus*)(新的：*Isaria fumosorosea*)，特別是 IFPC 200613 菌株或 Apopka 97 菌株(登錄號 ATCC 20874)，淡紫擬青黴(*Paecilomyces lilacinus*)，特別是淡紫擬青黴 251 菌株(AGAL 89/030550)，黃藍狀菌(*Talaromyces flavus*)，特別是 V117b 菌株，深綠木黴菌(*Trichoderma atroviride*)，特別是 SC1 菌株(登錄號 CBS 122089)，哈氏木黴菌(*Trichoderma harzianum*)，特別是哈氏木黴菌(*T. harzianum rifai*)T39 菌株(登錄號 CNCM I-952)。

所使用或可用作生物性除害劑之病毒的實例有：

Adoxophyes orana(夏果卷葉蛾)顆粒體病毒(GV)、*Cydia pomonella* (蘋果蠹蛾)顆粒體病毒(GV)、*Helicoverpa armigera* (棉鈴蟲)核型多角體病毒(NPV)、*Spodoptera exigua* (甜菜夜蛾) mNPV、*Spodoptera frugiperda* (秋行軍蟲) mNPV、*Spodoptera littoralis* (非洲棉葉蟲) NPV。

亦包括，藉由其特別的性質，提升植物生長和植物健康，加入作為植物或植物部位或植物器官之「接種劑」的細菌和真菌。實例包括：

農桿菌(*Agrobacterium spp.*)、根瘤菌(*Azorhizobium caulinodans*)、固氮螺旋菌(*Azospirillum spp.*)、固氮菌(*Azotobacter spp.*)、慢生根瘤菌(*Bradyrhizobium spp.*)、伯克氏菌(*Burkholderia spp.*)，特別是洋蔥伯克氏菌(*Burkholderia cepacia*)(之前稱為洋蔥假單胞菌(*Pseudomonas cepacia*))、大孢菌屬

(*Gigaspora* spp.)或單胞大孢菌(*Gigaspora monosporum*)、菌根繡球菌(*Glomus* spp.)、蠟蘑屬(*Laccaria* spp.)、布氏乳桿菌(*Lactobacillus buchneri*)、隱球囊黴菌(*Paraglomus* spp.)、彩色豆包菌(*Pisolithus tinctorus*)、假單胞菌屬(*Pseudomonas* spp.)、根瘤菌(*Rhizobium* spp.)，特別是三葉草根瘤菌(*Rhizobium trifolii*)、須腹菌(*Rhizopogon* spp.)、硬皮馬勃菌(*Scleroderma* spp.)、牛肝菌(*Suillus* spp.)、鏈黴菌(*Streptomyces* spp.)。

所使用或可用作生物性除害劑之植物萃取物及由微生物所形成的產物(包括蛋白和二級代謝物)有：

蒜(*Allium sativum*)、苦艾(*Artemisia absinthium*)、印苦楝子素(azadirachtin)、Biokeeper WP、*Cassia nigricans*、苦皮藤(*Celastrus angulatus*)、土荊芥(*Chenopodium anthelminticum*)、甲殼素(chitin)、Armour-Zen、歐洲鱗毛蕨(*Dryopteris filix-mas*)、問荊草(*Equisetum arvense*)、Fortune Aza、Fungastop、Heads Up (藜麥皂素萃取物)、除蟲菊/除蟲菊酯、蘇利南苦木(*Quassia amara*)、櫟(*Quercus*)、皂樹(*Quillaja*)、Regalia、「Requiem™殺昆蟲劑」、魚藤酮(rotenone)、尼亞那(ryania)/雷諾丁(ryanodine)、聚合草(*Symphytum officinale*)、菊蒿(*Tanacetum vulgare*)、百里酚(thymol)、Triact 70、TriCon、金蓮花(*Tropaeolum majus*)、蕁麻(*Urtica dioica*)、藜蘆鹼(Veratrin)、槲寄生(*Viscum album*)、十字花科萃取物，特別是菜籽油菜粉或芥菜粉。

安全劑作為混合組份

式(I)或式(I')之化合物可與安全劑組合，例如解草酮(benoxacor)、解毒啞(cloquintocet (-mexyl))、解草胺腈(cyometrinil)、cyprosulfamide、二氯丙烯胺(dichlormid)、解草唑(-乙基) (fenchlorazole-ethyl)、解草啖(fenclorim)、解草胺(flurazole)、氟草肟(fluxofenim)、解草惡唑(furilazole)、雙苯惡唑酸(-乙酯)(isoxadifen-ethyl)、吡咯二酸(-二乙酯) (mefenpyr-diethyl)、萘二甲酸

酐(naphthalic anhydride)、解草腓(oxabetrinil)、2-甲氧基-N-({4-[(甲基胺甲醯基)胺基]苯基}磺醯基)苯甲醯胺(CAS 129531-12-0)、4-(二氯乙醯基)-1-氧雜-4-氮雜螺環[4.5]癸烷(CAS 71526-07-3)、2,2,5-三甲基-3-(二氯乙醯基)-1,3-噁唑啉(CAS 52836-31-4)。

植物及植物部位

依照本發明所有的植物和植物部位皆可處理。植物在本文中應了解係指所有的植物和植物群族，例如所欲的及不欲的野生植物或作物植物(包括天然生成的作物植物)，例如穀類(小麥、稻米、黑小麥、大麥、裸麥、燕麥)、玉米、大豆、馬鈴薯、甜菜、甘蔗、番茄、甜椒、小黃瓜、甜瓜、紅蘿蔔、西瓜、洋蔥、萵苣、菠菜、韭菜、菜豆、甘藍(例如高麗菜)及其他蔬菜種類，棉花、菸草、菜籽油菜以及水果植物(水果有蘋果、梨、柑橘水果和葡萄)。作物植物可為可藉由習用育種和優化方法或藉由生物技術和基因工程方法或這些方法的組合所獲得之植物，包括基因轉殖植物及包括有或無受植物品種權保護之植物品種。植物應了解係指所有的發育階段，例如種子、苗、幼(未成熟)植株、直到並包括成熟植株。植物部位應了解係指植物之所有的地上和地下的植物部位及器官，例如芽、葉、花和根，實例有葉、刺、枝、莖、花、子實體、果實和種子，以及根、塊莖及地下莖。植物部位亦包括採收植物及無性和生殖性繁殖物質，例如插枝、塊莖、地下莖、接條和種子。

本發明以式(I)或式(I')化合物處理的植物和植物部位係直接進行或藉由習用的處理方法，例如以浸泡、噴灑、蒸發、霧化、撒播、塗刷、注射讓化合物作用在周圍、棲地或儲存空間，且就繁殖物質之情況，特別是種子的情況，亦藉由塗覆一或多層塗層來進行。

如上已提及的，依照本發明可處理所有的植物及其部位。在一較佳的

實施例中，係處理野生植物類和植物栽培品種，或該等由習用生物育種方法，例如交叉或原生質融合所得到的植物及其部位。在另一較佳的實施例中，係處理由基因工程方法所得來的基因轉殖植物和植物栽培品種及其部位，若適當係與習用的方法組合(基因改造生物)。術語「部位」或「植物部位」已於上文中說明。依照本發明特佳的係處理個別市售的習用植物栽培品種或使用中的植物。植物栽培品種請了解係指具有新穎性質(「特色(traits)」)及藉由習用育種，藉由突變或藉由重組 DNA 技術所得來的植物。其可為栽培品種、品種、生物型或基因型。

基因轉殖植物、種子處理和整合事件

可依照本發明處理之較佳的基因轉殖植物或植物栽培品種(由基因工程所獲得)包括所有經由基因改造、接受賦予這些植物特定有利的有用性質之基因物質(「特色」)的所有植物。此等性質之實例有較佳的植物生長、增加對高溫或低溫的耐受性、增加對乾旱或對水量或土壤鹽分的耐受性、增進開花表現、較容易採收、加速成熟、較高的收穫產量、採收產物之較高的品質及/或較高的營養價值、收穫產物之較佳的儲存期及/或加工性。此等性質之進一步和特別強調的實例有改善植物對抗動物和微生物害蟲之防禦力，例如由於，例如在植物中形成毒素，特別是該等藉由來自蘇力菌的遺傳物質在植物中形成毒素(例如藉由基因 CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb 和 CryIF，以及其組合)來對抗昆蟲、蜘蛛類、線蟲、蟎、蛭蟪、和蝸牛，以及由於，例如藉由系統性後天獲得之抗病性(SAR)、系統素、植物抗菌素、誘導子以及阻抗基因和對應表現蛋白和毒素而增加植物對抗植物病原性真菌、細菌及/或病毒的阻抗性，以及增加植物對特定活性除草成份，例如咪唑啉酮、磺酰脲、嘉磷塞(glyphosate)或草胺膦(phosphinothricin)(例如「PAT」

基因)之耐受力。賦予所欲性質(「特色」)之所指基因亦可彼此組合存在於基因轉殖植物中。可提及的基因轉殖植物之實例有重要的作物植物，例如穀類(小麥、稻米、黑小麥、大麥、裸麥、燕麥)、玉米、大豆、馬鈴薯、甜菜、甘蔗、番茄、豌豆和其他蔬菜種類，棉花、菸草、菜籽油菜以及水果植物(水果有蘋果、梨、柑橘水果和葡萄)，其中特別強調地係給予玉米、大豆、小麥、稻米、馬鈴薯、棉花、甘蔗、菸草和菜籽油菜。特別強調的性質(「特色」)為增加植物對昆蟲、蜘蛛類、線蟲和蛭蟪及蝸牛的抗性。

作物保護—處理類型

以式(I)或式(I')之化合物處理植物和植物部位係直接進行或使用習用的處理方法，例如以浸泡、噴灑、噴霧、灌溉、蒸發、撒粉、霧化、撒播、泡沫、塗刷、散佈其上、注射、淋、滴灌作用在其周圍、棲地或儲存空間，且就繁殖物質之情況，特別是種子的情況，另外係以乾燥種子處理、液體種子處理、漿液處理，藉由包被、藉由塗覆一或多層塗層等來進行。再者亦可能藉由超低容量法來施用式(I)或式(I')化合物，或將式(I)或式(I')化合物的施用形式或其本身注射至土壤中。

一較佳的直接植物處理為葉敷，亦即將式(I)或式(I')化合物施用於葉片，在該情況下處理的頻率和施用率應根據被所指昆蟲群襲的程度作調整。

就系統性活性成份之情況，式(I)或式(I')化合物亦經由根系進入植物中。在該情況下，係藉由將式(I)或式(I')化合物作用在植物的棲地來處理植物。此項例如可藉由澆淋或藉由混入土壤或營養溶液中來進行，其係指以液體形式的式(I)或式(I')化合物灌注植物的所在地(例如土壤或水耕系統)，或藉由土壤施用其係指將本發明之式(I)或式(I')化合物以土壤形式(例如以顆粒形式)導入植物的所在地。就稻穀作物之情況，此項亦可藉由量取固體施用形式的式(I)或式(I')化合物(例如為顆粒)至浸水的稻田中來進行。

種子處理

藉由處理植物的種子來防治動物害蟲所已知久且為持續改良之主體。然而，種子之處理牽涉一系列的問題，其總是無法以令人滿意的方法得到解決。因此，希望發展用於保護種子及發芽植物之方法，其係在儲存期間、播種後或植物出苗後免除或至少顯著降低施用額外的除害劑。另外希望將所用的活性成份之量最適化，以便提供種子和發芽植物最佳的保護，免於動物害蟲之攻擊，但是植物本身亦不會受到所用的活性成份傷害。特言之，處理種子之方法亦應考慮害蟲阻抗性或耐受性基因轉殖植物原有的殺昆蟲、殺線蟲性質，以便於以最少的除害劑消費量達到種子以及發芽植物之最佳保護。

本發明因此，特言之，亦關於藉由以式(I)或式(I')化合物處理種子來保護種子和發芽植物免於害蟲攻擊之方法。用於保護種子和發芽植物對抗害蟲攻擊之本發明方法進一步係包括其中該種子係同時以單一操作或連續以式(I)或式(I')化合物及一混合組份處理種子。本發明亦包括其中種子在不同的時間以式(I)或式(I')化合物及一混合組份處理種子之方法。

本發明同樣係關於本發明之式(I)或式(I')化合物用於處理種子供保護種子和所生成的植物而避免動物害蟲之用途。

本發明進一步係關於經本發明之式(I)或式(I')化合物處理過以供保護避免動物害蟲之種子。本發明亦關於同時以式(I)或式(I')化合物及一混合組份處理之種子。本發明進一步係關於在不同的時間以式(I)或式(I')化合物及一混合組份處理之種子。就於不同的時間點以式(I)或式(I')化合物及一混合組份處理之種子的情況，個別的物質可以不同層存在種子上。就此情況，包括式(I)或式(I')化合物及一混合組份之各層可視需要以一中間層分開。本發明亦關於其中已施用式(I)或式(I')化合物及一混合組份作為一塗層之部

份或作為另外的塗層或塗層以外的額外層之種子。

本發明進一步係關於在以式(I)或式(I')化合物處理後，進行塗膜程序以防止種子磨損之種子。

系統性使式(I)或式(I')化合物生效之優點之一為，藉由處理種子不僅保護種子本身，其亦在植物出苗後阻擋動物害蟲。以此法，可免除在播種時或在播種後不久立即處理農作物。

另一項優點為經式(I)或式(I')化合物處理種子可增進處理過的種子之發芽和出苗。

同樣視為有利的是，式(I)或式(I')化合物特別亦可用於基因轉殖種子。

式(I)或式(I')化合物可與訊息傳遞技術組成物組合使用，藉由共生體，例如根瘤菌(rhizobia)、菌根(mycorrhizae)及/或內寄生細菌或真菌，產生較佳的拓殖及/或最佳的氮固定。

式(I)或式(I')化合物適用於保護任何農業、溫室、森林或園藝栽培中所用的任何植物種類之種子。更特言之，此項有穀類(例如小麥、大麥、裸麥、裸麥、小米和燕麥)、玉米、棉花、大豆、稻米、馬鈴薯、向日葵、咖啡、菸草、芥花菜、菜籽油菜、甜菜(例如糖用甜菜和飼料甜菜)、花生、蔬菜(例如番茄、小黃瓜、菜豆、十字花科蔬菜、洋蔥和萵苣)、水果植物、草皮和觀賞植物之種子。其中特別重要的為穀類(例如小麥、大麥、裸麥和燕麥)、玉米、大豆、棉花、芥花菜、菜籽油菜、蔬菜及稻米之種子處理。

如上文已提及的，以式(I)或式(I')化合物處理的基因轉殖種子亦特別重要。此項係涉及植物種子，其一般含有至少一種控制具有特別是殺昆蟲性及/或殺線蟲性質之多肽表現的異源基因。基因轉殖種子的異源基因可源自微生物，例如桿菌、根瘤菌、假單胞菌(*Pseudomonas*)、沙雷氏菌(*Serratia*)、

木黴菌(*Trichoderma*)、棒狀桿菌(*Clavibacter*)、菌根菌(*Glomus*)或膠狀青黴菌(*Gliocladium*)。本發明特別適用於處理含有至少一個源自桿菌屬之異源基因的基因轉植種子。異源基因特佳地係衍生自蘇力菌。

在本發明內文中，此式(I)或式(I')化合物係施用於種子。較佳地，係以其中夠穩定使得處理期間不會造成任何傷害之狀態來處理該種子。一般而言，種子可在介於採收至播種間的任何時間來處理。通常所用的種子係已從植株分離並去除果實之穗軸、殼、梗、外皮、毛鬚或果肉。例如，可能使用已採收、清潔及乾燥至溼度低到得以儲存之種子。另一種選擇，亦可能使用乾燥後，經例如水處理及然後再乾燥，例如滲調(*priming*)之種子。就稻米種子的情況，亦可能使用，例如經浸泡於水中至稻米胚芽的特定階段(「鴿胸期(*pigeon breast stage*)」)之種子，刺激發芽和更均勻出苗。

一般而言，在處理種子時，必須確保施用於種子之式(I)及/或式(I')化合物之量及/或另外的添加物之量係以對種子之發芽不會有不利影響，或不會傷害所生成的植物之方式來選擇。當活性成份在特定的施用率可能具有植物毒性效應之情況下時，此項必須特別謹記在心。

式(I)或式(I')之化合物一般係以適合的調配物的形式施用於種子。用於種子處理之適合的調配物和方法已為熟習本項技術者所知。

式(I)或式(I')之化合物可轉變為習用的拌種調配物，例如溶液、乳液、懸浮液、粉劑、泡沫、漿液或其他種子用的包覆組成物，以及 ULV 調配物。

這些調配物係以已知的方法藉由將式(I)或式(I')化合物與習用的添加劑，例如習用的增量劑以及溶劑或稀釋劑、染劑、濕潤劑、分散劑、乳化劑、消泡劑、防腐劑、第二增稠劑、黏著劑、赤黴素以及水混合所製備。

依照本發明可使用的拌種調配物中可存在的染劑為所有習用於此等

目的之染劑。難溶於水或可溶於水的色素皆可使用。實例包括名稱為羅丹明 B (Rhodamin B)、顏料紅 112 (C.I. Pigment Red 112)及溶劑紅 1 (C.I. Solvent Red 1)之已知的染劑。

依照本發明可使用的拌種調配物中可存在的有用濕潤劑為所有增進濕潤度及習用於農化活性成份調配物之物質。較佳可使用的有烷基萘磺酸酯，例如萘磺酸二異丙基酯或二異丁基酯。

依照本發明可使用的拌種調配物中可存在的適合分散劑及/或乳化劑為所有習用於活性農化成份調配物之非離子、陰離子和陽離子分散劑。較佳地可使用非離子或陰離子分散劑，或非離子或陰離子分散劑之混合物。適合的非離子分散劑特別是包括環氧乙烷/環氧丙烷嵌段聚合物、烷基酚聚乙二醇醚和三苯乙烯酚聚乙二醇醚及其磷酸化或硫酸化衍生物。適合的陰離子分散劑有，特別是木質磺酸鹽、聚丙烯酸鹽和芳基磺酸酯-甲醛縮合物。

依照本發明可使用的拌種調配物中可存在的消泡劑為所有習用於活性農化成份調配物之泡沫抑制物質。較佳地可使用矽消泡劑及硬脂酸鎂。

依照本發明可使用的拌種調配物中可存在的防腐劑為就此目的可用於農化組成物中的所有物質。實例包括雙氯酚及苯甲基醇半縮甲醛。

依照本發明可使用的拌種調配物中可存在的用第二增稠劑為就此目的可用於農化組成物中的所有物質。較佳的實例包括纖維素衍生物、丙烯酸衍生物、三仙膠、修飾黏土及細粉狀矽氧。

依照本發明可使用的拌種調配物中可存在的黏著劑為可用於拌種產品之所有習用結著劑。較佳的實例包括聚乙烯吡咯酮、聚乙烯乙酸酯、聚乙烯醇及甲基纖維素(tylose)。

依照本發明可使用的拌種調配物中可存在的赤黴素較佳地為赤黴素

A1、A3(=赤黴酸)、A4 和 A7；特佳地係使用赤黴酸。赤黴素為已知的(參照 R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412)。

依照本發明可使用的拌種調配物可直接使用或先以水稀釋後供處理廣泛範圍的不同類之種子。例如，藉由以水稀釋從其可得到的濃縮劑或製劑可用於拌合穀類種子，例如小麥、大麥、裸麥、燕麥和黑小麥，以及玉米、稻米、菜籽油菜、豌豆、菜豆、棉花、向日葵、大豆和甜菜之種子，或其他廣泛種類的不同蔬菜種子。依照本發明可使用的拌種調配物或其稀釋的使用形式亦可用於基因轉植植物之拌種。

對於以依照本發明可使用的拌種調配物，或以藉由添加水從其所製備的使用形式之種子處理而言，習用上可用於伴種之所有的混合元件皆為有用的。特言之，拌種程序係將種子置入混合器中，逐批或連續操作，直接加入或先以水稀釋後加入特定所欲之量的拌種產品調配物，及將所有的東西混合直到調配物均勻地分佈在種子上。若適當，其可接著一乾燥操作。

依照本發明可使用的拌種調配物之施用率可在相當廣泛的範圍內變化。其係根據調配物中式(I)或式(I')化合物之特定含量及種子而定。式(I)或式(I')化合物之施用率一般每公斤種子係介於 0.001 至 50 g，較佳地每公斤種子係介於 0.001 至 15 g。

動物健康

在動物健康的領域，亦即在獸藥的領域中，式(I)或式(I')化合物可有效對抗動物寄生蟲，特別是體外寄生蟲或體內寄生蟲。術語「體內寄生蟲」包括，特別是蠕蟲和原生動物，例如球蟲。體外寄生蟲典型及較佳地有節肢動物，特別是昆蟲和蟎。

在獸藥的領域中，式(I)或式(I')化合物具有有利的恆溫動物毒性，係適

合用於防治在動物飼養上和畜牧業家畜、飼養動物、動物園動物、實驗室動物、實驗動和家畜中所遭遇的寄生蟲。其可有效對抗所有或特定發育階段的寄生蟲。

農畜包括，例如，哺乳動物，例如綿羊、山羊、馬、驢、駱駝、水牛、兔、馴鹿、黠鹿及特別是牛和豬；或禽類例如火雞、鴨、鵝及特別是雞；或魚類或甲殼類，例如水產養殖；或視情況而定，昆蟲，例如蜜蜂。

家養動物包括，例如，哺乳動物，例如倉鼠、天竺鼠、大鼠、小鼠、栗鼠、雪貂及特別是狗、貓、籠鳥；爬蟲類、兩棲類或水族箱魚。

在一特別的實施例中，式(I)或式(I')之化合物係投予哺乳動物。

在另外特別的實施例中，式(I)或式(I')之化合物係投予鳥類，亦即籠鳥或特別是禽類。

使用式(I)或式(I')之化合物來防治動物寄生蟲係希望降低或預防疾病、死亡案件和效能損失(就肉、乳、羊毛、獸皮、蛋、蜂蜜及其類似物之情況)，使其可能做到更經濟和更簡單的動物飼養及達到較佳的動物福祉。

在有關動物健康的領域中，術語「防治」在本文中係指示式(I)或式(I')化合物可有效地降低受此等寄生蟲感染的動物中特定寄生蟲發生率至無害的程度。更特言之，「防治」在本文中，係指式(I)或式(I')化合物殺死個別的寄生蟲，抑制其生長或抑制其增殖。

節肢動物包括，例如(但不限於)：

來自蝨目(Anoplurida)，例如血蝨(Haematopinus spp.)、顎蝨(Linognathus spp.)、蝨(Pediculus spp.)、陰蝨(Phtirus spp.)和管蝨(Solenopotes spp.)；

來自羽蝨目(Mallophagida)及鈍角亞目(Amblycerina)和絲角亞目(Ischnocerina)，例如毛蝨(Bovicola spp.)、蝨(Damalina spp.)、鳥蝨(Felicola spp.)、蝨(Lepikentron spp.)、雞蝨(Menopon spp.)、毛蝨(Trichodectes spp.)、

蝨(*Trimenopon* spp.)、鴨蝨(*Trinoton* spp.)、咬蝨(*Werneckiella* spp.)；
來自雙翅目(*Diptera*)和長角亞目(*Nematocera*)及短角亞目(*Brachycera*)，
例如斑蚊(*Aedes* spp.)、瘧蚊(*Anopheles* spp.)、蜂蝨(*Braula* spp.)、麗蠅
(*Calliphora* spp.)、金蠅(*Chrysomya* spp.)、麗蠅(*Chrysomya* spp.)、家蚊
(*Culex* spp.)、庫蠅(*Culicoides* spp.)、真蚋(*Eusimulium* spp.)、廁蠅(*Fannia*
spp.)、胃蠅(*Gasterophilus* spp.)、舌蠅(*Glossina* spp.)、血蠅(*Haematobia* spp.)、
麻虻(*Haematopota* spp.)、蝨蠅(*Hippobosca* spp.)、瘤虻(*Hybomitra* spp.)、齒
股蠅(*Hydrotaea* spp.)、皮蠅(*Hypoderma* spp.)、蝨蠅(*Lipoptena* spp.)、綠蠅
(*Lucilia* spp.)、沙蠅(*Lutzomyia* spp.)、蜉蠓(*Melophagus* spp.)、莫蠅(*Morellia*
spp.)、家蠅(*Musca* spp.)、短蚋(*odagmia* spp.)、狂蠅(*Oestrus* spp.)、虻
(*Philipomyia* spp.)、蛉(*Phlebotomus* spp.)、鼻狂蠅(*Rhinoestrus* spp.)、肉蠅
(*Sarcophaga* spp.)、紡蚋(*Simulium* spp.)、螫蠅(*Stomoxys* spp.)、虻(*Tabanus*
spp.)、維蚋(*Wilhelmia* spp.)、污蠅(*Wohlfahrtia* spp.)；

來自蚤目(*Siphonapterida*)，例如蚤(*Ctenocephalides* spp.)、角葉蚤
(*Ceratophyllus* spp.)、蚤(*Pulex* spp.)、潛蚤(*Tunga* spp.)、鼠蚤(*Xenopsylla*
spp.)；

來自異翅目(*Heteropterida*)，例如臭蟲(*Cimex* spp.)、錐蝨(*Panstrongylus* spp.)、
錐蝨(*Rhodnius* spp.)、廣錐獵蝨(*Triatoma* spp.)；以及來自蜚蠊目(*Blattarida*)
煩人及衛生害蟲。

此外，就節肢動物的情況可提及的有例如(不限於)下列蜱蟎(*Acari*)：
來自蜱蟎亞綱[*Acari*(*Acarina*)]及中氣門蟎目(*Mesostigmata*)，例如如來自軟
蜱科(*Argasidae*)如軟蜱屬(*Argas* spp.)、鈍緣蜱(*Ornithodoros* spp.)、殘喙蜱
(*Otobius* spp.)，來自硬蜱科(*Ixodidae*)如花蜱(*Amblyomma* spp.)、革蜱
(*Dermacentor* spp.)、血蜱(*Haemophysalis* spp.)、璃眼蜱(*Hyalomma* spp.)、

硬蜱屬(*Ixodes* spp.)、牛蜱(*Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp.)、扇頭蜱(*Rhipicephalus* spp.)(多宿主蜱之原屬名)；來自中氣門蟎目(*Mesostigmata*)如刺蟎(*Dermanyssus* spp.)、禽刺蟎(*Ornithonyssus* spp.)、肺刺蟎(*Pneumonyssus* spp.)、瑞列屬(*Raillietia* spp.)、氣囊蟎(*Sternostoma* spp.)、小蜂蟎(*Tropilaelaps* spp.)、瓦蟎(*Varroa* spp.)；來自輻蟎目(*Actiniedida*)[前氣門亞目(*Prostigmata*)]，例如蜂盾蟎(*Acarapis* spp.)、恙蟎(*Cheyletiella* spp.)、蠕形蟎(*Demodex* spp.)、聲蟎(*Listrophorus* spp.)、肉蟎(*Myobia* spp.)、*Neotrombicula* spp.、寄生蟎(*Ornithocheyletia* spp.)、癢蟎(*Psorergates* spp.)、恙蟎(*Trombicula* spp.)；及來自粉蟎目(*Acaridida*)[無氣門目(*Astigmata*)]，例如毛囊蟲屬(*Acarus* spp.)、嗜木蟎(*Caloglyphus* spp.)、足蟎(*Chorioptes* spp.)、氣囊蟎(*Cytodites* spp.)、皮蟎(*Hypodectes* spp.)、膝蟎(*Knemidocoptes* spp.)、皮膜蟎(*Laminosioptes* spp.)、背肛蟎(*Notoedres* spp.)、耳蟎(*Otodectes* spp.)、癢蟎(*Psoroptes* spp.)、翅蟎(*Pterolichus* spp.)、疥蟎(*Sarcoptes* spp.)、疥蟎(*Trixacarus* spp.)、食酪蟎(*Tyrophagus* spp.)。

寄生性原生動物之實例包括(但不限於)：

鞭毛蟲[*Mastigophora* (*Flagellata*)]，例如：

後滴門：來自雙滴蟲目(*Diplomonadida*)，例如毛滴蟲(*Trichomonadidae*)，例如賈第氏滴蟲(*Giardia lamblia*)、六鞭毛蟲(*Spironucleus* spp.)

副基體(*Parabasala*)：來自毛滴蟲目(*Trichomonadida*)，例如組織毛滴蟲(*Histomonas* spp.)、五鞭滴蟲(*Pentatrichomonas* spp.)、四鞭滴蟲(*Tetratrichomonas* spp.)、四鞭滴蟲(*Trichomonas* spp.)、毛滴蟲(*Tritrichomonas* spp.)

眼蟲：來自：錐蟲目，例如利什曼屬(*Leishmania* spp.)、錐蟲(*Trypanosoma* spp.)

肉鞭門(Sarcomastigophora)(根足蟲(Rhizopoda))例如內阿米巴科(Entamoebidae)，例如內阿米巴屬(Entamoeba spp.)，Centamoebidae，例如刺阿米巴蟲(Acanthamoeba sp.)，Euamoebidae，例如哈氏蟲(Hartmanella sp.)

囊泡蟲，例如頂複門(Apicomplexa)(孢子蟲(Sporozoa))：例如隱孢子蟲屬(Cryptosporidium spp.)；來自艾美球蟲目(Eimeriida)，例如貝諾孢子蟲屬(Besnoitia spp.)、等孢子球蟲(Cystoisospora spp.)、艾美球蟲 Eimeria spp.、哈蒙球蟲(Hammondia spp.)、等孢球蟲屬(Isospora spp.)、新孢蟲(Neospora spp.)、肉孢子蟲屬(Sarcocystis spp.)、弓蟲(Toxoplasma spp.)；來自阿黛爾球蟲目(Adeleida)，例如肝簇蟲(Hepatozoon spp.)、克洛西艾拉屬(Klossiella spp.)；來自血孢子目(Haemosporida)，例如住血原蟲(Leucocytozoon spp.)、瘧原蟲(Plasmodium spp.)；來自梨形蟲目(Piroplasmida)，例如巴貝氏原蟲屬(Babesia spp.)、纖毛蟲(Ciliophora spp.)、Echinozoon spp.、泰勒原蟲(Theileria spp.)；來自(Vesiculiferida)，例如腸纖毛蟲(Balantidium spp.)、Buxtonella spp.。

微孢藻，例如腦胞內原蟲屬(Encephalitozoon spp.)、腸胞蟲(Enterocytozoon spp.)、球蟲屬(Globidium spp.)、微孢子蟲(Nosema spp.)，以及，例如黏體動物(Myxozoa spp.)。

人類或動物之病原性寄生蟲包括，例如棘頭動物(Acanthocephala)、線蟲動物門(Nematoden)、舌形蟲(Pentastoma)和扁形動物(platyhelmintha)[例如單殖亞綱(Monogenea)、條蟲綱(Cestoda)和吸蟲綱(Trematoda)]。

說明性的寄生蟲包括(但不限於)：

單殖亞綱：例如：指環蟲屬(Dactylogyrus spp.)、三代條蟲屬(Gyrodactylus spp.)、小盤吸蟲(Microbothrium spp.)、多盤吸蟲屬(Polystoma spp.)、Troglocephalus spp.；

條蟲綱(Cestoda)：來自假葉目(Pseudophyllidea)，例如沟槽條蟲(Bothridium spp.)、裂頭條蟲屬(Diphyllobothrium spp.)、復殖孔屬(Diplogonoporus spp.)、Ichthyobothrium spp.、舌狀條蟲屬(Ligula spp.)、裂首條蟲屬(Schistocephalus spp.)、裂頭條蟲屬(Spirometra spp.)

來自圓葉目(Cyclophyllidea)，例如：Andrya spp.、裸頭條蟲屬(Anoplocephala spp.)、無卵黃線條蟲屬(Avitellina spp.)、伯特條蟲屬(Bertiella spp.)、錫帶條蟲屬(Cittotaenia spp.)、大衛條蟲屬(Davainea spp.)、雙峯條蟲屬(Diorchis spp.)、複孔條蟲(Dipylidium spp.)、刺球條蟲屬(Echinococcus spp.)、Echinocotyle spp.、Echinolepis spp.、泡尾條蟲屬(Hydatigera spp.)、膜殼條蟲(Hymenolepis spp.)、約優克斯條蟲屬(Joyeuxiella spp.)、中擬條蟲(Mesocetoides spp.)、蒙尼條蟲屬(Moniezia spp.)、副裸頭條蟲屬(Paranoplocephala spp.)、雷氏條蟲屬(Raillietina spp.)、斯泰條蟲屬(Stilesia spp.)、條蟲(Taenia spp.)、曲子宮條蟲屬(Thysaniezia spp.)、縫體條蟲屬(Thysanosomus spp.)

吸蟲：來自複殖綱(Digenea)，例如澳畢吸蟲屬(Austrobilharzia spp.)、短咽吸蟲屬(Brachylaima spp.)、杯殖吸蟲屬(Calicophoron spp.)、下彎吸蟲屬(Catantropis spp.)、Clonorchis spp.、肚瘤吸蟲屬(Collyriclum spp.)、殖盤吸蟲屬(Cotylophoron spp.)、環腸吸蟲屬(Cyclocoelum spp.)、雙腔吸蟲屬(Dicrocoelium spp.)、雙穴吸蟲屬(Diplostomum spp.)、棘隙吸蟲屬(Echinochasmus spp.)、棘緣吸蟲屬(Echinoparyphium spp.)、棘口吸蟲(Echinostoma spp.)、腸吸蟲屬(Eurytrema spp.)、肝片吸蟲屬(Fasciola spp.)、Fasciolides spp.、薑片吸蟲屬(Fasciolopsis spp.)、腹囊雙口吸蟲(Fischöderius spp.)、腹袋吸蟲屬(Gastrothylacus spp.)、巨畢吸蟲屬(Gigantobilharzia spp.)、巨盤吸蟲屬(Gigantocotyle spp.)、異型吸蟲

(*Heterophyes* spp.)、寡肉吸蟲屬(*Hypodemeum* spp.)、彩蚴吸蟲屬(*Leucochloridium* spp.)、後殖吸蟲(*Metagonimus* spp.)、次睪吸蟲屬(*Metorchis* spp.)、小葉吸蟲屬(*Nanophyetus* spp.)、背孔吸蟲屬(*Notocotylus* spp.)、後睪吸蟲屬(*Opisthorchis* spp.)、鳥睪吸蟲屬(*Ornithobilharzia* spp.)、並殖吸蟲屬(*Paragonimus* spp.)、同端盤吸蟲屬(*Paramphistomum* spp.)、斜睪吸蟲(*Plagiorchis* spp.)、莖雙穴吸蟲屬(*Posthodiplostomum* spp.)、前殖吸蟲屬(*Prosthogonimus* spp.)、血吸蟲屬(*Schistosoma* spp.)、毛睪吸蟲屬(*Trichobilharzia* spp.)、多主吸蟲屬(*Troglostrongylus* spp.)、胃腔屬(*Typhlocoelum* spp.)

線蟲：來自旋毛蟲目(*Trichinellida*)：例如：毛細屬(*Capillaria* spp.)、旋毛形線蟲屬(*Trichinella* spp.)、*Trichomosoides* spp.、鞭蟲屬(*Trichuris* spp.)；來自墊刃線蟲目(*Tylenchida*)，例如：微線蟲屬(*Micronema* spp.)、*Parastrongylus* spp.、類圓線蟲屬(*Strongyloides* spp.)。

來自桿線蟲目(*Rhabditina*)例如：貓圓線蟲屬(*Aelurostrongylus* spp.)、裂口線蟲屬(*Amidostomum* spp.)、鉤蟲屬(*Ancylostoma* spp.)、血管圓線蟲屬(*Angiostrongylus* spp.)、*Bronchonema* spp.、仰口線蟲屬(*Bunostomum* spp.)、夏伯特線蟲屬(*Chabertia* spp.)、古柏線蟲屬(*Cooperia* spp.)、類古柏線蟲(*Cooperioides* spp.)、環體蟲屬(*Crenosoma* spp.)、杯口線蟲屬(*Cyathostoma* spp.)、*Cyclocercus* spp.、環齒口鉤蟲(*cyclodontostomum* spp.)、杯冠線蟲屬(*Cylicostephanus* spp.)、杯環線蟲(*Cylicocyclus* spp.)、環冠線蟲(*Cylicostephanus* spp.)、柱咽線蟲(*Cylindropharynx* spp.)、囊尾線蟲屬(*Cystocaulus* spp.)、網尾線蟲屬(*Dictyocaulus* spp.)、鹿圓線蟲屬(*Elaphostrongylus* spp.)、類絲形線蟲屬(*Filaroides* spp.)、球頭線蟲屬(*Globocephalus* spp.)、圖紋線蟲(*Graphidium* spp.)、輻首線蟲屬

(*Gyalocephalus* spp.)、血矛線蟲屬(*Haemonchus* spp.)、螺旋線蟲(*Heligmosomoides* spp.)、豬圓線蟲屬(*Hyostrongylus* spp.)、馬歇爾線蟲屬(*Marshallagia* spp.)、後圓線蟲屬(*Metastrongylus* spp.)、繆勒線蟲述(*Muellerius* spp.)、鉤蟲(*Necator* spp.)、細頸線蟲屬(*Nematodirus* spp.)、新圓線蟲屬(*Neoststrongylus* spp.)、日本圓線蟲(*Nippostrongylus* spp.)、劍形線蟲屬(*Obeliscoides* spp.)、食管齒線蟲屬(*Oesophagodontus* spp.)、結節線蟲屬(*Oesophagostomum* spp.)、盤頭線蟲屬(*Ollulanus* spp.)；鳥圓線蟲(*Ornithoststrongylus* spp.)、奧斯勒線蟲(*Oslerus* spp.)、奧斯特線蟲屬(*Ostertagia* spp.)、副古柏線蟲(*Paracooperia* spp.)、副環棘線蟲屬(*Paracrenosoma* spp.)、類副絲形線蟲屬(*Parafilaroides* spp.)、副鹿圓線蟲屬(*Parelaphoststrongylus* spp.)、杯口線蟲屬(*Poteriostomum* spp.)、肺圓線蟲屬(*Pneumoststrongylus* spp.)、肺尾線蟲(*Pneumocaulus* spp.)、杯口線蟲屬(*Poteriostomum* spp.)、原圓線蟲屬(*Protostrongylus* spp.)、銳尾線蟲屬(*Spicocaulus* spp.)、冠尾線蟲屬(*Stephanurus* spp.)、圓型線蟲屬(*Strongylus* spp.)、比翼線蟲屬(*Syngamus* spp.)、背帶線蟲(*Teladorsagia* spp.)、毛線線蟲屬(*Trichonema* spp.)、毛圓線蟲屬(*Trichostrongylus* spp.)、三齒線蟲屬(*Triodontophorus* spp.)、竇圓線蟲(*Trogloststrongylus* spp.)、鉤口線蟲屬(*Uncinaria* spp.)。

來自旋尾目(*Spirurida*)，例如：刺唇屬(*Acanthocheilonema* spp.)、異尖線蟲屬(*Anisakis* spp.)、禽蟲回蟲屬(*Ascaridia* spp.)；蛔蟲屬(*Ascaris* spp.)、似蛔線蟲(*Ascarops* spp.)、無刺線蟲屬(*Aspicularis* spp.)、貝利斯蛔蟲(*Baylisascaris* spp.)、布魯絲蟲屬(*Brugia* spp.)、*Cercopithifilaria* spp., 肥尾線蟲(*Crassicauda* spp.)、雙瓣絲蟲屬(*Dipetalonema* spp.)、惡絲蟲屬(*Dirofilaria* spp.)、龍線蟲屬(*Dracunculus* spp.)、德拉西線蟲屬(*Draschia* spp.)、

住腸屬(*Enterobius* spp.)、絲蟲屬(*Filaria* spp.)、鄂口線蟲屬(*Gnathostoma* spp.)、筒線蟲屬(*Gongylonema* spp.)、麗線蟲屬(*Habronema* spp.)、異刺線蟲屬(*Heterakis* spp.)；棉鼠絲蟲屬(*Litomosoides* spp.)、羅阿絲蟲(*Loa* spp.)、蟠尾絲蟲(*Onchocerca* spp.)、尖尾線蟲屬(*Oxyuris* spp.)、副柔線蟲屬(*Parabronema* spp.)、副絲蟲屬(*Parafilaria* spp.)、副蛔蟲屬(*Parascaris* spp.)、栓尾線蟲(*Passalurus* spp.)、泡翼線蟲屬(*Physaloptera* spp.)、普氏線蟲屬(*Probstmayria* spp.)、擬絲蟲屬(*Pseudofilaria* spp.)、腹腔絲蟲屬(*Setaria* spp.)、*Skjrabinema* spp.、旋尾線蟲(*Spirocerca* spp.)、冠絲蟲屬(*Stephanofilaria* spp.)、圓線蟲(*Strongyluris* spp.)、管狀線蟲屬(*Syphacia* spp.)、吸吮線蟲屬(*Thelazia* spp.)、毒蛔蟲屬(*Toxascaris* spp.)、弓蛔蟲屬(*Toxocara* spp.)、吳策線蟲屬(*Wuchereria* spp.)。

棘頭動物(*Acanthocephal*)：來自寡棘吻目(*Oligacanthorhynchida*)，例如：巨吻棘頭蟲屬(*Macracanthorhynchus* spp.)、前巨睪棘頭蟲屬(*Prosthenorchis* spp.)；來自念珠目(*Moniliformida*)，例如：念珠棘蟲屬(*Moniliformis* spp.)。

來自多形目(*Polymorphida*)，例如：*Filicollis* spp.；來自棘吻目(*Echinorhynchida*)，例如，棘頭蟲(*Acanthocephalus* spp.)、巨吻棘頭蟲(*Echinorhynchus* spp.)、類細吻棘頭蟲屬(*Leptorhynchoides* spp.)。

舌形動物門(*Pentastoma*)：來自孔頭目(*Porocephalida*)，例如，舌形蟲屬(*Linguatula* spp.)。

在獸醫領域及動物畜牧業中，式(I)或式(I')化合物之給藥係以適合的製備物形式藉由本項技術中一般已知的方法來給藥，例如經由腸內、非經腸、皮膚或鼻內路徑。給藥可為預防性、後預防性或治療性。

因此，本發明之一實施例係指式(I)或式(I')化合物用作為醫藥品之用

途。

另一方面係關於式(I)或式(I')化合物用作為抗-體內寄生蟲劑。

本發明另一特定方面係關於式(I)或式(I')化合物用作為抗寄生蟲劑，特別是用作為殺線蟲劑、殺扁形蟲劑，殺棘頭蟲劑或殺舌形蟲劑。

本發明另一特定方面係關於式(I)或式(I')化合物用作為抗原生動物劑。

另一面係關於式(I)或式(I')化合物用作為抗-體外寄生蟲劑，特別是殺節肢動物劑，非常特言之殺昆蟲劑或殺蟎劑。

本發明之另外方面為獸藥條配物，其係包括一有效量之至少一種式(I)或式(I')化合物及至少一種下列物質：醫藥上相容的賦形劑(例如固體或液體稀釋劑)，特別是習用於獸藥條配物之醫藥上相容的賦形劑及/或習用於獸藥條配物之醫藥上相容的輔助劑。

本發明一相關的方面為製造如文中所述之獸藥條配物的方法，其係包括將至少一種式(I)或式(I')化合物與醫藥上相容的賦形劑及/或輔助劑混合，特別是與習用於獸藥條配物之醫藥上相容的賦形劑及/或習用於獸藥條配物之醫藥上相容的輔助劑混合之步驟。

根據所提及的方面及其製造方法，本發明另一方面為獸藥調配物，其係由殺體內寄生蟲和殺體外寄生蟲調配物之群中選出，特言之係由驅蠕蟲、抗原生動物和殺節肢動物調配物之群中選出，非常特言之係由殺線蟲、殺扁形蟲，殺棘頭蟲、殺舌形蟲、殺昆蟲和殺蟎調配物之群中選出。

另一方面係關於藉由在一有此需要之動物特別是非人類動物中，使用一有效量的式(I)或式(I')化合物治療寄生蟲感染之方法，特言之由文中所提之體外寄生蟲和體內寄生蟲之群中選出的寄生蟲所造成之感染。

另一方面係關於藉由在一有此需要之動物特別是非人類動物中，使用

如文中所定義之獸藥調配物治療寄生蟲感染之方法，特言之由文中所提之體外寄生蟲和體內寄生蟲之群中選出的寄生蟲所造成之感染。

另一方面係關於在一動物特別是非人類動物中，式(I)或式(I')化合物於治療寄生蟲感染之用途，特別是由文中所提之體外寄生蟲和體內寄生蟲之群中選出的寄生蟲所造成之感染。

在動物健康或獸藥的內容中，術語「治療」係包括預防性、後預防性和治療性治療。

在一特別的實施例中，係以至少一種式(I)或式(I')化合物與其他活性成份之混合物，特別是與殺體內和殺體外寄生蟲劑之混合物的方式，提供用於獸藥領域。

在動物健康的領域中，「混合物」不僅係指二(或多種)不同的活性成份調配於共同的調配物中及相應地共同使用，並且係關於包括各活性成份為分開的調配物之產品。因此，當使用二種以上的活性成份時，所有的活性成份可調配於共同的調配物中，或所有的活性成份可調配於分開的調配物中；同樣可能的有其中某些活性成份係共同調配而某些活性成份係分開調配之混合形式。分開的調配物能分開或連續施用所指的活性成份。

文中以其通用名稱指稱之活性成份已為所知且係描述於，例如 "Pesticide Manual" 中 (參見上文) 或可在網路上搜尋 (例如：<http://www.alanwood.net/pesticides>)。

來自殺體外寄生蟲劑作為混合組份之說明性的活性成份，在無任何此項應構成限制之意圖下，係包括詳細列於上文之殺昆蟲劑和殺蟎劑。另外可使用的活性成份係依照上述分類以目前 IRAC Mode of Action Classification Scheme 為基礎列於下：(1)乙醯膽鹼酯酶(AChE)抑制劑；(2)GABA-閘控氯離子通道阻斷劑；(3)鈉通道調節劑；(4)尼古丁乙醯膽鹼

受體(nAChR)競爭性調節劑；(5)尼古丁乙醯膽鹼受體(nAChR)之變構調節劑；(6)麩胺酸-閘控氯離子通道(GluCl)變構調節劑；(7)保幼激素模擬物；(8)混雜非特定(多位置)抑制劑；(9)弦音器官調節劑；(10)蟎生長抑制劑；(12)粒線體 ATP 合成酶之抑制劑，例如 ATP 擾亂劑；(13)經由擾亂質子梯度之氧化磷酸化去偶合劑；(14)尼古丁乙醯膽鹼受體通道阻斷劑；(15)甲殼素生物合成抑制劑，第 0 型；(16)甲殼素生物合成抑制劑，第 1 型；(17)蛻皮干擾劑(特別是雙翅目之情況)；(18)蛻皮素受體促效劑；(19)奧克巴胺(octopamine)受體促效劑；(21)粒線體複合物 I 電子傳遞抑制劑；(25)粒線體複合物 II 電子傳遞抑制劑；(20)粒線體複合物 III 電子傳遞抑制劑；(22)電壓-依賴的鈉通道阻斷劑；(23)乙醯基-CoA 羧基酶之抑制劑；(28)雷若丁(ryanodine)受體調節劑；

具有未知或非特定作用機制之活性成份，例如氟硝二苯胺(fenitrothion)、fenoxacrim、環孢靈(cycloprene)、克氯苯(chlorobenzilate)、殺蟲脒(chlordimeform)、氟蟲噻(flubenzimidazole)、地昔尼爾(dicyclanil)、磺胺嘧啶(amidoflumet)、喹甲硫酯(quinomethionat)、苯蟲噻(triarathene)、clothiazoben、tetrasul、油酸鉀、石油、惡蟲酮(metoxadiazole)、gossyplur、flutenzine、新殺蟎(bromopropylate)、冰晶石(cryolite)；

來自其他類之化合物，例如畜蟲威(butacarb)、地麥威(dimethilan)、除線威(cloethocarb)、磷蟲威(phosphocarb)、蟲蟎磷(乙基)(pirimiphos(-ethyl))、巴拉松(乙基)(parathion(-ethyl))、蟲蟎畏(methacrifos)、鄰-水楊酸異丙酯、三氯松(trichlorfon)、甲丙硫磷(sulprofos)、加護松(propaphos、硫線磷(sebufos)、pyridathion、飛克松(prothoate)、除線磷(dichlofenthion)、滅賜松磺(demeton-S-methyl sulfone)、依殺松(isazofos)、施力松(cyanofenphos)、得拉松(dialifos)、三硫磷(carbophenothion)、特噤硫磷(autathiofos)、穀速松(甲

基)(aromfenvinfos(-methyl))、azinphos(-ethyl)、陶斯松(乙基)(chlorpyrifos(-ethyl))、丁苯硫磷(fosmethilan)、碘硫磷(iodofenphos)、殺力松(dioxabenzofos)、福木松(formothion)、大福松(fonofos)、吡氟硫磷(flupyrazofos)、繁福松(fensulfothion)、益多松(etrinfos)；

有機氯化物，例如毒殺芬(camphenchlor)、林丹(lindane)、七氯(heptachlor)；或苯基吡啶，例如乙醯蟲腈 acetoprole、pyrafluprole、pyriprole、vaniliprole、維吉黴素(sisapronil)；或異噁唑啉，例如 sarolaner、阿弗索拉納(afoxolaner)、lotilaner、fluralaner；

類除蟲菊精，例如(順、反-)美特寧(metofluthrin)、丙氟菊酯(profluthrin)、弗路芬普洛(flufenprox)、flubrocycythrinate、伏本斯(fubfenprox)、芬氟司林(fenfluthrin)、protrifenbut、吡思菊酯(pyresmethrin)、RU15525、環戊烯丙菊酯(terallethrin)、順-苄呋菊酯(cis-resmethrin)、heptafluthrin、苄呋烯菊酯(bioethanomethrin)、生物氯菊酯(biopermethrin)、芬普寧 fenpyrithrin)、賽滅寧(cis-cypermethrin)、百滅寧(cis-permethrin)、功夫菊酯(clocythrins)、賽洛寧(cyhalothrin (lambda-))、二氯炔戊菊酯(chlovaporthrin)，或鹵化烴化合物(HCH)，

新菸鹼類(neonicotinoid)，例如硝蟲噻嗪(nithiazine)

dicloromezotiaz、triflumezopyrim

大環內酯類，例如奈馬克丁(nemadectin)、伊維菌素(ivermectin)、拉替菌素(latidectin)、莫西菌素(moxidectin)、沙拉菌素(selamectin)、埃普利諾菌素(eprinomectin)、朵拉菌素(doramectin)、因滅汀(emamectin benzoate)；米爾貝肼(milbemycin oxime)

烯蟲硫酯(triprene)、保幼醚(epofenonane)、二苯丙醚(diofenolan)；

生物製劑、荷爾蒙或資訊素，例如天然產物，例如蘇力菌素(thuringiensin)、

十二碳二烯醇(codlemone)或苦楝樹(neem)組成份；

二硝基酚，例如敵蟊普(dinocap)、大脫蟊(dinobuton)、百蟊克(binapacryl)；

苯甲醯脲，例如氟佐隆(fluzuron)、氟幼脲(penfluron)，

脘衍生物，例如殺蟲脘(chlormebuform)、蟊蜚胺(cymiazole)、得米地曲(demiditraz)

蜂窩瓦蟊殺蟊劑，例如有機酸，例如甲酸、草酸。

來自殺體內寄生蟲劑之群作為混合組份之說明性活性成份，包括(但不限於)活性抗蟊蟲成份及活性抗原生動物成份。

活性抗蟊蟲成份包括(但不限於)下列活性殺線蟲、殺白蟻及/或殺條蟲成份：

來自大環內酯類，例如埃普利諾菌素(eprinomectin)、阿巴汀(abamectin)、奈馬克丁(nemadectin)、莫西菌素(moxidectin)、朵拉菌素(doramectin)、沙拉菌素(selamectin)、雷匹美汀(lepimectin)、拉替菌素(latidectin)、密滅汀(milbemectin)、伊維菌素(ivermectin)、因滅汀(emamectin)、米貝菌素(milbemycin)；

來自苯并咪唑類和 pro-苯并咪唑類，例如奧苯達唑(oxibendazole)、甲苯咪唑(mebendazole)、三氯苯咪唑(triclabendazole)、多保淨(thiophanate)、氟苯達唑(parbendazole)、奧吩達唑(oxfendazole)、奈托比胺(netobimin)、芬苯達唑(fenbendazole)、非班太(febantel)、噻苯達唑(thiabendazole)、環苯達唑(cyclobendazole)、坎苯達唑(cambendazole)、阿苯達唑亞砒(albendazole sulfoxide)、阿苯達唑(albendazole)、氟苯達唑(flubendazole)；

來自酯肽類，較佳的環酯肽，特別是 24-員環酯肽，例如：emodepside、PF1022A；

來自四氫嘧啶，例如：摩朗得(morantel)、抗蟲靈(pyrantel)、奧克生太

(oxantel)；

來自咪唑并噻唑，例如：布他米唑(butamisol)、levamisole、噻咪唑(tetramisol)；

來自胺基苯甲脒類，例如：阿米登太(amidantel、deacylated amidantel (dAMD)、三苯雙脒(tribendimidine)；

來自胺基乙脒類，例如：monepantel；

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

來自水楊酸苯胺類，例如：三溴水楊胺(tribromsalan)、溴氟硝柳胺(bromoxanide)、溴替尼特(brotianide)、氯碘沙尼(clioxanide)、氯生太爾(closantel)、耐克螺(niclosamide)、五氯柳胺(oxyclozanide)、碘醚柳胺(rafoxanide)；

來自經取代酚類，例如：硝經碘苄脒(nitroxynil)、硫氯酚(bithionol)、二碘硝基酚(disophenol)、六氯酚(hexachlorophen)、雙硝氯酚(niclofolan)、meniclopholan；

來自有機磷酸類，例如：三氯松(trichlorfon)、naphthalofos、二氯松(dichlorvos/DDVP)、克蘆磷酯(crufomate)、蠅毒磷(coumaphos)、海洛松(haloxon)；

來自哌啶酮/喹啉類，例如：吡喹酮(praziquantel)、依西太爾(epsiprantel)；

來自哌啶類，例如：哌啶、經哌(hydroxyzine)；

來自四環黴素類，例如：四環黴素(tetracycline)、氯四環素(chlorotetracycline)、多西環素(doxycycline)、氧四環素(oxytetracycline)、樂力四環素(rolitetracycline)；

來自各種其他類，例如：西萘脒(bunamidine)、替硝唑(niridazole)、雷瑣命

太(resorantel)、omphalotin、奧替普拉(oltipraz)、硝硫氰酯(nitroscanate)、硝羰碘苄腈(nitroxynil)、oxamniquin、mirasan、米来西(miracil)、魯坎松(lucanthon)、hycanthon、海托林(hetolin)、吐根素(emetin)、乙胺嗪(diethylcarbamazine)、雙氯酚(dichlorophen)、地芬尼太(diamfenetide)、氯硝西洋(clonazepam)、苄芬宁(bephenium)、硝硫氰胺(amoscanate)、氯舒隆(clorsulon)。

活性抗原生動物成份包括(但不限於)下列活性成份：

來自三吡類，例如：地克珠利(diclazuril)、泊那珠利(ponazuril)、來曲珠利(letrazuril)、妥曲珠利(toltrazuril)；

來自聚醚離子載體類(polyether ionophore)，例如：莫能菌素(monensin)、鹽黴素(salinomycin)、馬杜黴素(maduramicin)、甲基鹽黴素(narasin)；

來自大環內酯類，例如：米貝菌素(milbemycin)、紅黴素(erythromycin)；

來自喹啉酮類，例如：恩諾沙星(enrofloxacin)、普多沙星(pradofloxacin)；

來自奎寧類(quinine)，例如：氯奎(chloroquin)；

來自嘧啶類，例如：嘧啶甲胺(pyrimethamine)；

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

來自硫胺類，例如：安保寧(amprolium)；

來自林肯醯胺類(lincosamide)，例如：克林達黴素(clindamycin)；

來自 碳醯苯胺類，例如：咪多卡(imidocarb)；

來自硝基呋喃類，例如：硝呋噻氧(nifurtimox)；

來自來自喹啉酮生物鹼類，例如：鹵夫酮(halofuginone)；

來自，例如：奧沙尼喹(oxamniquin)、巴龍黴素(paromomycin)；

來自疫苗或微生物之抗原類，例如羅西型犬焦蟲(Babesia canis rossi)、盲

腸型球蟲(*Eimeria tenella*)、早熟艾美球蟲(*Eimeria praecox*)、毒害艾美球蟲(*Eimeria necatrix*)、和緩艾美球蟲(*Eimeria mitis*)、巨型艾美球蟲(*Eimeria maxima*)、布氏艾美球蟲(*Eimeria brunetti*)、堆型艾美球蟲(*Eimeria acervulina*)、佛氏犬焦蟲(*Babesia canis vogeli*)、嬰兒利什曼原蟲(*Leishmania infantum*)、犬焦蟲(*Babesia canis canis*)、牛肺蟲(*Dictyocaulus viviparus*)。

所有所提及的混合成份，視情況而定，以其功能基為基準，若能夠的話，亦可與適合的鹼或酸形成鹽類。

病媒防治

式(I)或式(I')化合物亦可用於病媒防治。在本發明內文中，病媒為一能從儲存宿主(植物、動物、人類等)傳遞病原，例如病毒、蟲、單細胞生物及細菌給宿主之節肢動物，特別是昆蟲或蜘蛛類。病原可經機械性傳遞(例如非叮咬蠅傳遞之砂眼)給宿主或注入後進到宿主中(例如蚊子之瘧原蟲)。

其傳遞的病媒和疾病或病原之實例有：

1)蚊子

- 瘧蚊：瘧疾、絲蟲病；
- 庫蚊：日本腦炎、絲蟲病、其他病毒疾病、其他蟲之傳播；
- 黑斑蚊：黃熱病、登革熱、其他病毒疾病、絲蟲病；
- 蚋：傳播蠕蟲，特別是蟠尾絲蟲病(*Onchocerca volvulus*)；
- 蛾蚋科：傳播利什曼原蟲病

2)虱：皮膚感染、流行性斑疹傷寒；

3)蚤：瘟疫、地方性斑疹傷寒、條蟲；

4)蠅：昏睡病(錐蟲病)；霍亂、其他細菌疾病；

5)蟎：疥癬、流行性斑疹傷寒、立克次痘疹、兔熱病、聖路易腦炎、蜱媒

腦炎(TBE)、克裡米亞- 剛果出血熱、包柔螺旋體病；

6)壁蝨：包柔螺旋體病例如伯氏疏螺旋體(*Borrelia burgdorferi sensu lato.*)、達頓氏疏螺旋體(*Borrelia duttoni*)、蜱媒腦炎、Q 熱(貝納氏立克次體(*Coxiella burnetii*))、巴貝斯蟲病(犬焦蟲(*Babesia canis canis*))、艾利希氏體症(*ehrlichiosis*)。

在本發明內文中病媒之實例有昆蟲，例如蚜蟲、蠅、葉蟬或薊馬，其能傳播植物病毒給植物。能傳播植物病毒之其他病媒有蛛蟎、虱、甲蟲和線蟲。

在本發明內文中另外的病媒實例有昆蟲和蜘蛛類，例如蚊子，特別是斑蚊屬、瘧蚊屬，例如岡比亞瘧蚊(*A. gambiae*)、阿拉伯按蚊(*A. arabiensis*)、不吉按蚊(*A. funestus*)、大劣按蚊(*A. dirus*)(瘧疾)和庫蚊，蛾蚋科，例如白蛉屬(*Phlebotomus*)、羅蛉屬(*Lutzomyia*)、虱、蚤、蠅、蟎和壁蝨，其能傳播病原給動物及/或人類。

若式(I)或式(I')化合物為阻抗破壞性，則病媒防治亦為可能的。

式(I)或式(I')之化合物適用於防阻由病媒所傳播的疾病及/或病原。因此，本發明另一方面為式(I)或式(I')化合物用於病媒防治之用途，例如在農業、園藝、林業、花園和休閒設施上，以及在材料保護和儲存產品上。

工業材料保護

式(I)或式(I')化合物適用於保護工業材料對抗昆蟲，例如來自鞘翅目(*Coleopter*)、膜翅目(*Hymenoptera*)、等翅目(*Isoptera*)、鱗翅目(*Lepidoptera*)、嚙蟲目(*Psocoptera*)和衣魚目(*Zygentoma*)之攻擊或破壞。

在本文中工業材料請了解係指無生命的物質，例如較佳地塑膠、黏著劑、膠料、紙和紙板、皮革、木材、加工木材產品及塗膜組成物。本發明用於木材保護之用途為特佳的。

在另一實施例中，式(I)或式(I')化合物係與至少另一種殺昆蟲劑及/或至少一種殺真菌劑一起使用。

在另一實施例中，式(I)或式(I')化合物係以一立即可用的除害劑形式呈現，亦即其可在無任何進一步修飾下施用於所指之物質。可用的另外殺昆蟲劑或殺真菌劑特別是包括該等上文所提及者。

令人驚訝地已發現，式(I)或式(I')化合物可用於保護與鹽水或鹼水接觸之物件，特別是外皮、屏風、網子、建築物、船碇及傳訊系統防污。同樣可能的，式(I)或式(I')化合物可單獨或與其他活性成份組合使用，作為防污劑。

衛生部份之動物害蟲防治

式(I)或式(I')化合物適用於在衛生部份防治動物害蟲。更特言之，本發明可用於家中保護部份，衛生防護部份及儲存產品保護，特別是用於防治在封閉空間，例如住家、工廠、辦公室、車廂、動物豢養設施中所遭遇到的昆蟲、蜘蛛類、蟬和蟎。就防治動物害蟲，式(I)或式(I')化合物係單獨或與其他活性成份及/或輔助劑組合使用。其較佳地係用於家用殺昆蟲劑產品。式(I)或式(I')化合物對於抗敏感性和抗藥性物種，以及對抗所有發育階段，為有效的。

這些害蟲包括，例如來自蛛形綱的害蟲，來自來蠍目(Scorpiones)、蜘蛛目(Araneae)和盲蛛目(Opilione)，來自唇足綱(Chilopoda)和倍足綱(Diplopoda)，來自昆蟲綱(Insecta)蜚蠊目(Blattaria)，來自鞘翅目(Coleoptera)、革翅目(Dermaptera)、雙翅目(Diptera)、異翅目(Heteroptera)、膜翅目(Hymenoptera)、等翅目(Isoptera)、鱗翅目(Lepidoptera)、毛蟲目(Phthiraptera)、嚙蟲目(Psocoptera)、跳躍亞目(Saltatoria)或直翅目(Orthoptera)、蚤目(Siphonaptera)和衣魚目(Zygentoma)及來自軟甲亞綱(Malacostraca)等翅

目。

施用係以，例如氣霧劑、無壓噴霧產品來進行，例如幫浦及霧化器噴霧、自動噴霧系統、煙霧機、泡沫、凝膠、帶有纖維素或塑化製成的蒸氣錠之蒸發器產品、液體蒸發器、凝膠及膜蒸發器、推進劑驅動的蒸發器、無能源或被動式蒸發系統、蛾紙、蛾袋及蛾膠，作為粒劑或粉劑，用於傳播誘餌或用於誘餌站。

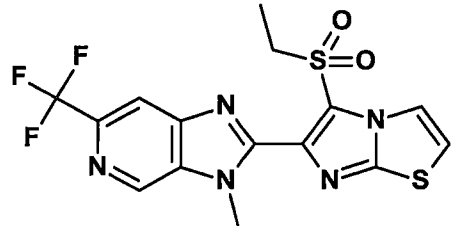
【圖式簡單說明】

無

【實施方式】

製備實例

5-乙基磺醯基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]咪唑并[2,1-b]噻唑(實例 I-1)

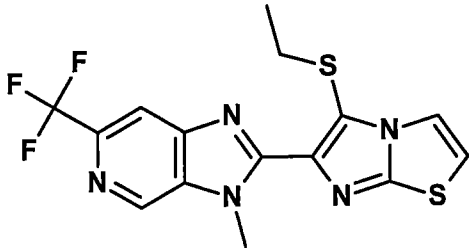


將 40 mg 的 5-乙基磺基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]咪唑并[2,1-b]噻唑(0.10 mmol)溶於 5.0 ml 的二氯甲烷。加入 0.020 ml 的甲酸(0.52 mmol)和 0.064 ml 的過氧化氫(0.73 mmol)並將生成的混合物於室溫下攪拌 16 h。以飽和的硫代硫酸鈉溶液清洗反應混合物。移出有機層，以硫酸鈉乾燥並濃縮。經由製備式 HPLC 以水/乙腈梯度作為溶離劑，藉由管柱層析純化殘餘物。

logP (HCOOH): 2.30 ; MH⁺: 416 ; ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ ppm: 8.96 (s, 1H), 8.27 (d, 1H), 8.12 (s, 1H), 7.19 (d, 1H), 4.25 (s, 3H), 4.10 (q, 2H), 1.43 (t,

3H).

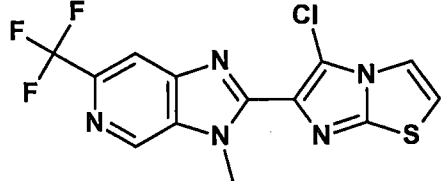
5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]咪唑并[2,1-b]噻唑(實例 I-2)



將 38 mg 的 5-氯-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]咪唑并[2,1-b]噻唑(0.10 mmol)溶於 3.0 ml 的 N,N-二甲基甲醯胺。於溶液中加入 18 mg 的硫代乙醇鈉(0.21 mmol)。然後於室溫攪拌混合物 16 h，另再加入 36 mg 的硫代乙醇鈉(0.42 mmol)並將混合物另再攪拌 16 h。以環己烷/乙酸乙酯之混合物稀釋反應混合物，經由矽藻土過濾並濃縮。在無進一步純化下將粗產物進一步轉化。

logP (HCOOH): 2.73 ; MH⁺: 384 ; ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ ppm: 8.90 (s, 1H), 8.14 (d, 1H), 7.76 (s, 1H), 7.05 (d, 1H), 4.30 (s, 3H), 4.47 (q, 2H), 1.22 (t, 3H).

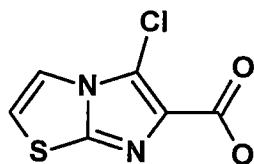
5-氯-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]咪唑并[2,1-b]噻唑



將 280 mg 的 5-氯咪唑并[2,1-b]噻唑-6-羧酸(1.10 mmol)、163 mg 的 N3-甲基-6-(三氟甲基)吡啶-3,4-二胺(0.85 mmol)和 163 mg 的 N-乙基-N'-(3-二甲基胺基丙基)碳二亞胺鹽酸鹽(0.85 mmol)溶於 10.0 ml 的吡啶。將混合物回流 16 h 及然後濃縮。經由製備式 HPLC 以水/乙腈梯度作為溶離劑，藉由管柱層析純化殘餘物。

logP (中性): 2.35 ; MH^+ : 358 ; ^1H -NMR (400MHz, $CDCl_3$) δ ppm: 8.90 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 4.36 (s, 3).

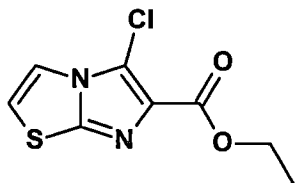
5-氯咪唑并[2,1-b]噻唑-6-羧酸



將 240 mg 的 5-氯咪唑并[2,1-b]噻唑-6-羧酸乙酯(1.04 mmol)溶於 30.0 ml 的四氫呋喃和 10.0 ml 的水之混合物中。然後於懸浮液中加入 44 mg 的氫氧化鋰單水合物(1.04 mmol)。將混合物於室溫攪拌 16 h，以 1.0 M 鹽酸(水溶液)酸化及然後濃縮。將殘餘物以甲苯進行共沸乾燥。在無進一步純化下將粗產物進一步轉化。

logP ($HCOOH$): 0.44 ; MH^+ : 203 ; ^1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 12.95 (br, 1H), 7.96 (d, 1H), 7.55 (d, 1H).

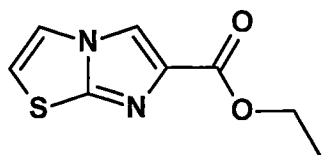
5-氯咪唑并[2,1-b]噻唑-6-羧酸乙酯



將 500 mg 的咪唑并[2,1-b]噻唑-6-羧酸乙酯(2.54 mmol)溶於 50.0 ml 的乙腈，及然後於溶液中加入 340 mg 的 N-氯琥珀醯亞胺(2.54 mmol)。漿混合物於 60°C 攪拌 8 h。冷卻至室溫後，將反應混合物濃縮，並將殘餘物與水混合及以二氯甲烷萃取。將有機層以硫酸鈉乾燥並濃縮。將粗產物藉由管柱層析於矽膠上以環己烷/乙酸乙酯混合物純化。

logP ($HCOOH$): 1.52 ; MH^+ : 231 ; ^1H -NMR (400MHz, $CDCl_3$) δ ppm: 7.44 (d, 1H), 7.06 (d, 1H), 4.43 (q, 2H), 1.44 (t, 3H).

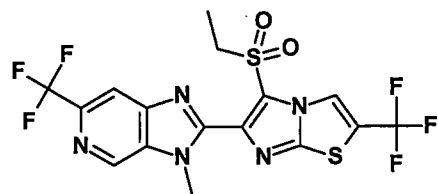
咪唑并[2,1-b]噻唑-6-羧酸乙酯



將 5.00 g 的 2-氨基噻唑(49.9 mmol)溶於 100 ml 的乙醇。將 9.74 g 的 3-溴丙酮酸乙酯(49.9 mmol)加到混合物中，然後將其回流 3 h。冷卻至室溫後，將反應混合物濃縮並將殘餘物藉由管柱層析於矽膠上以環己烷/乙酸乙酯混合物純化。

logP (中性): 0.99 ; MH^+ : 197 ; ^1H -NMR (400MHz, D6-DMSO) δ ppm: 8.38 (s, 1H), 7.92 (d, 1H), 7.42 (d, 1H) ; 4.26 (q, 2H), 1.29 (t, 3H).

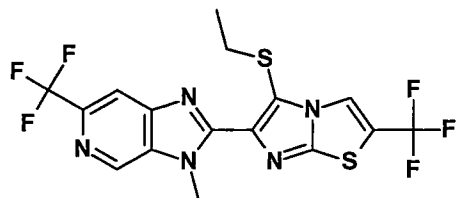
5-乙基磺基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-2-(三氟甲基)咪唑并[2,1-b]噻唑(實例 I-3)



將 180 mg 的 5-乙基磺基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-2-(三氟甲基)咪唑并[2,1-b]噻唑(0.39 mmol)溶於 5.0 ml 的二氯甲烷。加入 0.075 ml 的甲酸(1.99 mmol)和 0.24 ml 的過氧化氫(2.79 mmol)並將生成的混合物於室溫攪拌 16 h。以飽和的硫代硫酸鈉溶液清洗反應混合物。移出有機層，以硫酸鈉乾燥並濃縮。將殘餘物藉由管柱層析於矽膠上以二氯甲烷/甲醇梯度作為溶離劑純化。

logP (HCOOH): 3.38 ; $[M+H]^+$: 484 ; ^1H -NMR (400MHz, $CDCl_3$) δ ppm: 8.98 (s, 1H), 8.90 (s, 1H), 8.13 (s, 1H), 4.27 (s, 3H), 4.19 (q, 2H), 1.46 (t, 3H).

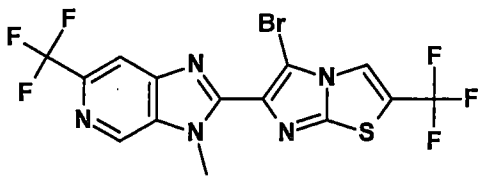
5-乙基磺基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-2-(三氟甲基)咪唑并[2,1-b]噻唑(實例 I-6)



將 313 mg 的 5-溴-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-2-(三氟甲基)咪唑并[2,1-b]噻唑(0.66 mmol)溶於 20.0 ml 的四氫呋喃。於溶液中加入 448 mg 的硫代乙醇鈉(5.32 mmol)。然後將混合物於室溫攪拌 16 h。將反應混合物與乙酸乙酯/H₂O 之混合物混合，經由矽藻土過濾並濃縮。將殘餘物藉由管柱層析於矽膠上以二氯甲烷/甲醇梯度作為溶離劑純化。

logP (HCOOH): 3.90 ; [M+H]⁺: 452 ; ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ ppm: 8.92 (s, 1H), 8.43 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 4.30 (s, 3H), 3.14 (q, 2H), 1.24 (t, 3H).

5-溴-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-2-(三氟甲基)咪唑并[2,1-b]噻唑

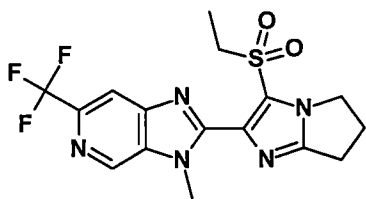


將 1.00 g 的 5-溴-2-(三氟甲基)咪唑并[2,1-b]噻唑-6-羧酸(3.17 mmol)、467 mg 的 N3-甲基-6-(三氟甲基)吡啶-3,4-二胺(2.44 mmol)和 468 mg 的 N-乙基-N'-(3-二甲基胺基丙基)碳二亞胺鹽酸鹽(2.44 mmol)溶於 20.0 ml 的吡啶。將 464 mg 的 4-甲苯磺酸單水合物(2.44 mmol)加到混合物中，然後將其回流 16 h。以乙腈稀釋混合物及過濾，並將濾液濃縮。將殘餘物藉由管柱層析於矽膠上以二氯甲烷/甲醇梯度作為溶離劑純化。

logP (中性): 3.43 ; [M+H]⁺: 470 ; ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ ppm: 8.92 (s, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.97 (d, 1H), 4.34 (s, 3H).

2-(3-乙基磺基-6,7-二氫-5H-吡嗪[1,2-a]咪唑-2-基)-3-甲基-6-(三氟甲基)-

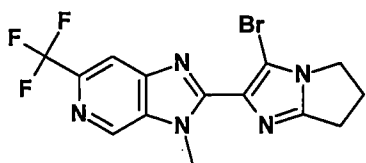
咪唑并[4,5-c]吡啶(實例 I-4)



將 160 mg 的 2-(3-溴-6,7-二氫-5H-吡咯[1,2-a]咪唑-2-基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶 e (0.20 mmol) 溶於 5.0 ml 的二甲基亞砜。於溶液中加入 3.9 mg 的碘化銅(I) (0.02 mmol)、5.7 mg 的 L-脯胺酸 (0.05 mmol) 和 241 mg 的乙基亞磺酸鈉 (2.07 mmol)。然後將混合物於 70°C 攪拌 8 h。以乙酸乙酯稀釋反應混合物並以水清洗。移出有機層，以 Na₂SO₄ 乾燥，過濾並濃縮。將粗產物藉由管柱層析經由製備式 HPLC 以水/乙腈梯度作為溶離劑純化。

logP (HCOOH): 1.97; [M+H]⁺: 400; ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ ppm: 8.91 (s, 1H), 8.08 (s, 1H), 4.41 (t, 2H), 4.19 (s, 3H), 4.04 (q, 2H), 3.06 (t, 2H), 2.74 (quint, 2H), 1.42 (t, 3H).

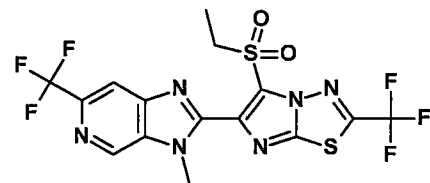
2-(3-溴-6,7-二氫-5H-吡咯[1,2-a]咪唑-2-基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶



將 2.90 g 的 3-溴-6,7-二氫-5H-吡咯[1,2-a]咪唑-2-羧酸鹽酸鹽 (10.8 mmol)、1.59 g 的 N3-甲基-6-(三氟甲基)吡啶-3,4-二胺 (8.33 mmol) 和 1.60 g 的 N-乙基-N'-(3-二甲基胺基丙基)碳二亞胺鹽酸鹽 (8.33 mmol) 溶於 50.0 ml 的吡啶。於混合物中加入 3.17 g 的 4-甲苯磺酸單水合物 (16.6 mmol)，然後將其回流 16 h。以乙腈稀釋反應混合物及過濾，並將濾液濃縮。將殘餘物藉由管柱層析於矽膠上以二氯甲烷/甲醇梯度作為溶離劑純化。

logP (中性): 2.07 ; [M+H]⁺: 388 ; ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ ppm: 8.85 (s, 1H), 8.13 (s, 1H), 4.28 (s, 3H), 4.08 (t, 2H), 3.07 (t, 2H), 2.73 (quint, 2H).

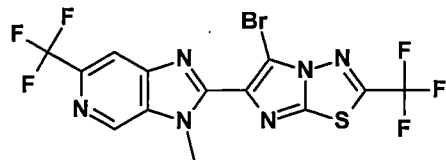
5-乙基磺醯基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-2-(三氟甲基)-咪唑并[2,1-b][1,3,4]噻二唑(實例 I-5)



將 50.0 mg 的 5-溴-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-2-(三氟甲基)咪唑并[2,1-b][1,3,4]噻二唑(0.10 mmol)溶於 2.0 ml 的二甲基亞砜。於溶液中加入 2.0 mg 的碘化銅(I)(0.01 mmol)、2.9 mg 的 L-脯胺酸(0.03 mmol)和 24.6 mg 的乙基亞磺酸鈉(0.21 mmol)。將混合物於 70°C 攪拌 8 h。另再加入 50.0 mg 的乙基亞磺酸鈉(0.42 mmol)並將混合物於 80°C 攪拌 8 h。隨後，另再加入 50.0 mg 的乙基亞磺酸鈉(0.42 mmol)並將混合物再次於 80°C 攪拌 8 h。以乙酸乙酯稀釋反應混合物並以水清洗。移出有機層，以 Na₂SO₄ 乾燥，過濾並濃縮。將粗產物藉由管柱層析經由製備式 HPLC 以水/乙腈梯度作為溶離劑純化。

logP (HCOOH): 2.68 ; [M+H]⁺: 485 ; ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) 69 ppm: 8.99 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 4.13 (s, 3H), 3.88 (q, 2H), 1.51 (t, 3H).

5-溴-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-2-(三氟甲基)咪唑并[2,1-b][1,3,4]噻二唑

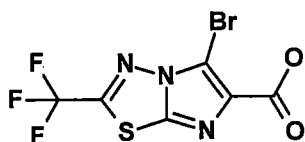


將 1.10 g 的 5-溴-2-(三氟甲基)咪唑并[2,1-b][1,3,4]噻二唑-6-羧酸(3.48 mmol)、512 mg 的 N3-甲基-6-(三氟甲基)吡啶-3,4-二胺(2.67 mmol)和 513 mg

的 N-乙基-N'-(3-二甲基氨基丙基)碳二亞胺鹽酸鹽(2.67 mmol)溶於 30.0 ml 的吡啶。將 1.02 g 的 4-甲苯磺酸單水合物(5.35 mmol)加到混合物中，然後將其回流 16 h。隨後於反應混合物中另再加入 1.02 g 的 4-甲苯磺酸單水合物(5.35 mmol)，將其另再回流 16 h。以乙腈稀釋反應混合物及過濾，並將濾液濃縮。將殘餘物經由矽膠過濾並濃縮。在無進一步純化下將粗產物進一步轉化。

logP (中性): 3.33 ; $[M+H]^+$: 471 ; $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ ppm: 8.94 (s, 1H), 8.19 (s, 1H), 4.33 (s, 3H).

5-溴-2-(三氟甲基)咪唑并[2,1-b][1,3,4]噻二唑-6-羧酸



將 1.00 g 的 2-(三氟甲基)咪唑并[2,1-b][1,3,4]噻二唑-6-羧酸(4.21 mmol)溶於 10.0 ml 的 N,N-二甲基甲醯胺，並將 872 mg 的 N-溴琥珀醯亞胺(4.84 mmol)加到所得到的溶液中。將反應混合物於室溫攪拌 16 h。以乙酸乙酯稀釋混合物。以水和硫代硫酸鈉清洗有機層，移出，以 Na_2SO_4 乾燥並濃縮。logP (HCOOH): 1.64 ; $[M+H]^+$: 317 ; $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, d_6 -DMSO) δ ppm: 13.3 (br, 1H).

logP 值係根據 EEC Directive 79/831 Annex V.A8 以 HPLC (高效液相層析)於逆相管柱上(C 18)所測量。溫度：55°C。

酸性範圍內之 LC-MS 測量係於 pH 2.7 使用 0.1%甲酸和乙腈水溶液(含有 0.1%甲酸)作為溶離劑來進行；線性梯度從 10%乙腈至 95%乙腈。在表中稱為 logP (HCOOH)。

中性範圍內之 LC-MS 測量係於 pH7.8 以 0.001 莫耳濃度的碳酸氫銨水溶液和乙腈作為溶離劑來進行；線性梯度從 10%乙腈至 95%乙腈。表中

稱為 logP (中性)。

校準係使用具有已知 logP 值(logP 值係以滯留時間為基準藉由二個連續烷酮間的線性插值所測定)之非支鏈的烷-2-酮(具有 3 至 16 個碳原子)來進行。

所選的實例之 NMR 數據係以習用的形式列出(δ 值、多重態非裂、氫原子數目)或為 NMR 波峰列表。

在各情況下，係列出其中記錄 NMR 光譜的溶劑。

NMR 波峰列表法

所選的實例之 ^1H -NMR 數據係以 ^1H NMR-波峰列表之形式來撰寫。就各訊號波峰，係以 ppm 表示之 δ 值及然後括號中的訊號強度列出。不同訊號波峰之成對的 δ 值-訊號強度數目係以分號彼此隔開列出。

波峰列表之一實例因此係具有下列形式：

$\delta_1(\text{強度 } 1)$; $\delta_2(\text{強度 } 2)$; ; $\delta_i(\text{強度 } i)$; ; $\delta_n(\text{強度 } n)$

尖銳的訊號強度係與 NMR 光譜(以 cm 表示)所輸出的實例之訊號的高度相關並顯現真實的訊號強度比例。就廣波峰的情況，可能顯示數個波峰或訊號中央及其相對強度與光譜最高強度訊號之比較。

就 ^1H NMR 光譜之化學位移的校準，係使用四甲基矽烷及/或該溶劑的化學位移來進行，特別是在 DMSO 中所測量的光譜之情況。因此，四甲基矽烷波峰可能，但非必定，出現在 NMR 波峰列表中。

^1H NMR 波峰列表係與經典的 ^1H NMR 輸出相同且因此通常包括經典的 NMR 解釋中所列的所有波峰。

此外，如同經典 ^1H -NMR 輸出，其可顯示溶劑訊號、目標化合物之立體異構物訊號(同樣為本發明之主體)，及/或雜質之波峰。

當說明溶劑及/或水之 δ 範圍中的化合物訊號時，一般的溶劑波峰，

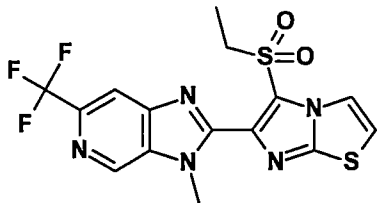
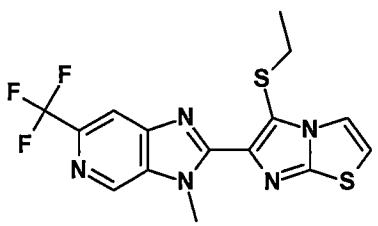
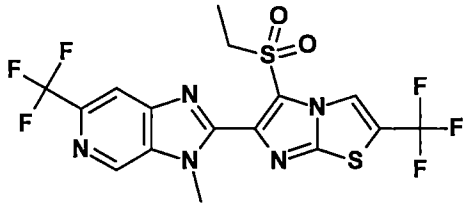
例如 DMSO-_{D6} 中之 DMSO 波峰及水波峰係顯示在 1H NMR 波峰列表中且通常平均上係具有高強度。

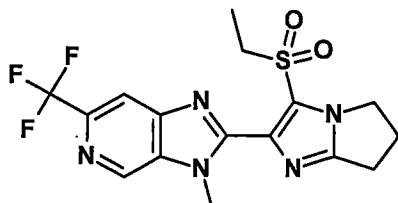
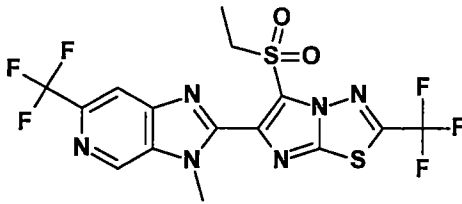
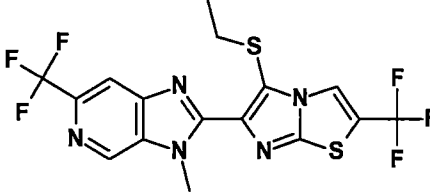
目標化合物之立體異構物波峰及/或雜質的波峰通常具有平均上低於目標化合物的強度(例如具有>90%純度)。

此等立體異構物及/或雜質可能為典型的特定製備方法。因此其波峰可能經由「副產物指紋」幫助辨識本製備方法中之再製。

以已知方法計算目標化合物波峰之專家(MestreC、ACD 模擬，以及以經驗評估預期的值)，若需要可視需要使用額外的強度過濾器，分離目標化合物波峰。此分離應與在經典 1H-NMR 說明中所挑選的相關波峰相類似。

就 1H NMR 波峰列表之詳情可參見 Research Disclosure Database Number 564025。

編號	結構	logP_(HCOOH)
I-1		2.30
I-2		2.73
I-3		3.38

I-4		1.97
I-5		2.68
I-6		3.90

實例 I-1: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.957(3.49); 8.277(2.97); 8.266(3.07); 8.121(3.65); 7.263(34.48); 7.195(2.83); 7.184(2.8); 5.3(7.33); 4.362(0.37); 4.246(16); 4.133(1.05); 4.114(3.37); 4.096(3.44); 4.077(1.08); 1.602(13.94); 1.535(0.35); 1.516(0.38); 1.498(0.37); 1.482(0.36); 1.478(0.36); 1.466(0.36); 1.449(3.7); 1.431(7.6); 1.412(3.55); 1.285(0.33); 1.254(1.9); 0.07(0.45); 0(3.97)
實例 I-2: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.996(0.34); 8.933(1.81); 8.9(3.89); 8.886(1.57); 8.197(1.86); 8.19(0.8); 8.162(0.46); 8.153(3.84); 8.13(3.24); 8.114(2.78); 8.015(2.18); 7.995(0.39); 7.957(0.36); 7.756(3.26); 7.726(2.82); 7.715(2.88); 7.691(0.75); 7.522(0.87); 7.508(0.33); 7.502(0.96); 7.491(1.01); 7.265(27.22); 7.112(0.98); 7.109(0.36); 7.101(0.93); 7.06(2.78); 7.049(2.67); 5.165(0.53); 4.444(0.87); 4.437(0.71); 4.417(0.46); 4.333(0.46); 4.315(1.08); 4.309(4.2); 4.299(16); 4.285(9.58); 4.273(0.65); 4.259(0.47); 4.038(0.39); 4.031(8.76); 3.846(0.61); 3.134(0.47); 3.115(1.93); 3.1(2.83); 3.097(4.47); 3.082(2.84); 3.079(4.47); 3.06(1.71); 3.043(0.91); 3.029(3.53); 3.016(3.62); 3.001(0.64); 2.991(0.44); 2.985(0.46); 2.956(14.77); 2.948(1.51); 2.934(1.23); 2.929(3.12); 2.916(1.36); 2.911(3.17); 2.893(1.37); 2.882(13.31); 2.862(0.58); 2.851(0.6); 2.843(0.52); 2.825(0.55); 2.81(0.73); 2.792(0.92); 2.775(0.9); 2.767(0.59); 2.756(0.85); 2.747(0.56); 2.738(0.81); 2.731(0.59); 2.719(0.71); 2.705(0.67); 2.687(0.53); 2.669(0.39); 2.659(0.38); 2.641(0.4); 2.633(0.35); 2.625(0.36); 2.554(0.38); 2.544(0.46); 2.535(0.35); 2.525(0.59); 2.505(0.51); 2.477(0.44); 2.458(0.58); 2.452(0.47); 2.439(0.5); 2.434(0.45); 2.429(0.38); 2.424(0.32); 2.131(1.93); 1.439(0.41); 1.427(0.62); 1.421(0.87); 1.408(0.49); 1.4(2.59); 1.394(1.2); 1.388(1.32); 1.381(5.28); 1.376(2.15); 1.372(2.27); 1.37(2.31); 1.363(3.52); 1.354(1.43); 1.351(1.4); 1.344(0.97); 1.337(0.76); 1.324(1.02); 1.32(1.01); 1.306(1.67); 1.287(1.34); 1.256(3.74); 1.247(3.59); 1.238(7.91); 1.229(5.75); 1.22(10.47); 1.21(3.23); 1.201(5.27); 1.188(1.43); 1.181(1.61); 1.177(2.17); 1.166(1.97); 1.158(3.08); 1.156(3.01); 1.148(2.8); 1.14(1.95); 1.13(1.63); 1.116(1.14); 1.111(1); 1.093(1.27); 1.075(1); 1.058(0.6); 0.992(0.44); 0.974(0.65); 0.964(0.62); 0.955(0.49); 0.946(0.89); 0.928(0.53); 0.913(0.39); 0.895(0.34); 0.88(0.34); 0(4.13)
實例 I-3: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.98(3.35); 8.901(0.37); 8.695(2.52); 8.692(2.49);

8.428(0.62); 8.133(3.56); 8.034(0.4); 7.262(13.8); 5.3(0.45); 4.461(1.18); 4.44(1.88); 4.266(16); 4.205(0.99); 4.187(3.31); 4.168(3.37); 4.15(1.07); 3.143(1.24); 3.135(1.35); 1.582(7.85); 1.479(3.43); 1.46(7.32); 1.442(3.33); 1.369(0.38); 1.35(0.74); 1.332(0.35); 0.008(0.5); 0(15.53)
實例 I-4: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.905(3.49); 8.081(3.75); 7.262(8.81); 5.3(8.56); 4.423(1.79); 4.405(2.55); 4.386(1.86); 4.289(0.36); 4.187(16); 4.055(1.04); 4.037(3.39); 4.018(3.42); 4(1.09); 3.074(1.53); 3.055(2.72); 3.035(2.02); 2.781(0.56); 2.762(1.44); 2.744(1.92); 2.724(1.28); 2.706(0.42); 1.578(3.55); 1.435(3.61); 1.416(7.63); 1.398(3.5); 0(5.94)
實例 I-5: ¹ H-NMR(601.6 MHz, CDCl ₃): δ= 9.208(1.11); 8.991(3.51); 8.321(1.2); 8.15(3.76); 7.261(31.87); 5.298(3.49); 4.477(5.33); 4.13(16); 4.029(1.29); 3.892(1.1); 3.879(3.57); 3.867(3.63); 3.855(1.15); 1.572(5.73); 1.512(4.03); 1.499(7.96); 1.487(3.8); 1.256(1.32); 0.005(0.8); 0(20.58)
實例 I-6: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.927(3.45); 8.902(1.95); 8.552(0.61); 8.428(2.76); 8.161(3.73); 8.122(2.44); 8.119(2.48); 8.036(2.01); 8.021(1.38); 8.018(1.37); 7.262(27.56); 5.3(0.69); 4.449(2.19); 4.441(8.48); 4.415(0.38); 4.3(16); 4.19(0.38); 3.378(0.47); 3.185(1.21); 3.166(3.82); 3.148(4.01); 3.142(1.18); 3.138(1.06); 3.13(1.46); 3.118(0.35); 3.057(0.54); 3.038(0.5); 3.029(0.32); 3.01(0.35); 1.576(9.91); 1.436(0.39); 1.426(0.57); 1.407(0.37); 1.356(0.79); 1.344(0.91); 1.337(1.4); 1.326(1.03); 1.32(1.08); 1.308(0.8); 1.303(0.72); 1.291(0.48); 1.285(0.47); 1.269(4.21); 1.251(8.48); 1.243(0.86); 1.232(4.25); 1.215(0.36); 0.008(1.06); 0(31.75); -0.008(1.33)

使用實例

貓蚤(*Ctenocephalides felis*)—成年貓蚤之活體外接觸試驗

就試管的塗覆，係將 9 mg 的活性成份先溶於 1 ml 的丙酮 p.a.及然後以丙酮 p.a.稀釋成所欲的濃度。藉由在迴旋式振盪器上翻轉及搖動將 250 µl 的溶液均勻分布在 25 ml 的玻璃試管的內壁和底部(以 30 rpm 進行 2 h 搖動旋轉)。得到含 900 ppm 活性成份溶液及 44.7 cm²內表面，為均勻分布 5 µg/cm²之面積基準劑量。

蒸發溶劑後，將 5-10 隻成年貓蚤(*Ctenocephalides felis*)移至玻璃試管，以多孔塑料蓋密封並以水平位置於室溫和環境濕度下培養。48 h 後，測定效力。為此，將試管豎直並將跳蚤敲至試管底部。在底部維持不動或以不協調方式移動的跳蚤，係視為死亡或瀕死的。

若在此試驗中以 5 µg/cm²的施用率達到至少 80%效力，則此物質係顯現良好的抗貓蚤效力。100%效力係指所有的跳蚤死亡或瀕死；0%係指無

跳蚤受到危害。

在此試驗中，例如，來自下列製備實例的化合物在 $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2 (=500 \text{ g/ha})$ 的施用率時顯現 100% 的效力：I-3

貓蚤(*Ctenocephalides felis*)-口服試驗

溶劑：二甲基亞碲

將10 mg的活性成份與0.5 ml的二甲基亞碲混合，製造一適合的活性成份調配物。以檸檬酸化牛血稀釋，得到成所欲的濃度。

將約20隻未餵食的貓蚤(*Ctenocephalides felis*)放入一頂部和底部以紗布蓋住之箱室中。將一底部以封口膜(parafilm)封住的金屬圓柱筒置入此箱室中。此圓柱筒含有血液/活性成份調配物，其可經由封口膜由跳蚤吸食。

2天後，測定死亡%。100%係指所有的跳蚤皆被殺死；0%係指無任何跳蚤被殺死。

在此試驗中，例如，來自下列製備實例的化合物在100 ppm的施用率時顯現95 %的效力：I-3

銅綠蠅(*Lucilia cuprina*)試驗

溶劑：二甲基亞碲

將10 mg的活性成份與0.5 ml的二甲基亞碲混合，製造一適合的活性成份調配物，並將此濃縮液以水稀釋成所欲的濃度。

將約20隻澳洲綿羊綠頭蠅(*Lucilia cuprina*)之L1幼蟲轉置於含有切碎馬肉和所欲濃度之活性成份調配物的試驗容器中。

2天後，測定死亡%。100%係指所有的幼蟲皆被殺死；0%係指無任何幼蟲被殺死。

在此試驗中，例如，來自下列製備實例的化合物在100 ppm的施用率時顯現100%的效力：I-3、I-4

家蠅(*Musca domestica*)試驗

溶劑：二甲基亞砜

將10 mg的活性成份與0.5 ml的二甲基亞砜混合，製造一適合的活性成份調配物，並將此濃縮液以水稀釋成所欲的濃度。

將10隻成年家蠅(*Musca domestica*)移至含有經糖溶液和所欲濃度之活性成份調配物處理過之海綿的容器中。

2天後，測定死亡%。100%係指所有的家蠅皆被殺死；0%係指無任何家蠅被殺死。

在此試驗中，例如，來自下列製備實例的化合物在100 ppm的施用率時顯現80%的效力：I-3

桃蚜(*Myzus persicae*)口服試驗

溶劑：100 重量份的丙酮

將1 重量份的活性成份以所述的溶劑重量份溶解，並加入水直到得到所欲的濃度，製造一適合的活性成份調配物。

將50 µl 的活性成份調配物轉置於微量滴定盤中並以150 µl 的 IPL41 蟲媒劑(33%+15%糖)加至200 µl 最終體積。隨後，以封口膜(parafilm)將滴定盤密封，而在第二微量滴定盤內的一混合綠桃蚜(*Myzus persicae*)群族能穿刺及經由封口膜吸食此溶液。

5 天後，測定效力%。100%係指所有的蚜蟲皆被殺死；0%係指無任何蚜蟲被殺死。

在此試驗中，例如，來自下列製備實例的化合物在20 ppm 的施用率時顯現100%的效力：I-3、I-4、I-5

桃蚜(*Myzus persicae*)—噴灑試驗

溶劑：78 重量份的丙酮

1.5 重量份的二甲基甲醯胺

乳化劑： 烷基芳基聚乙二醇醚

將 1 重量份的活性成份以所述的溶劑重量份溶解，並加入含有 1000 ppm 乳化劑濃度的水直到得到所欲的濃度，製造一適合的活性成份調配物。將調配物以含有乳化劑的水稀釋，產生另外的試驗濃度。

將經所有齡期之綠桃蚜(*Myzus persicae*)感染的大白菜(*Brassica pekinensis*)葉盤噴灑上所欲濃度之活性成份調配物。

5 天後，測定效力%。100%係指所有的蚜蟲皆被殺死；0%係指無任何蚜蟲被殺死。

在此試驗中，例如，來自下列製備實例的化合物在 500 g/ha 的施用率時顯現 90%的效力：I-4。

在此試驗中，例如，來自下列製備實例的化合物在 500 g/ha 的施用率時顯現 70%的效力：I-1、I-5。

辣根猿葉蟲(*Phaedon cochleariae*)— 噴灑試驗

溶劑： 78 重量份的丙酮

1.5 重量份的二甲基甲醯胺

乳化劑： 烷基芳基聚乙二醇醚

將 1 重量份的活性成份以所述的溶劑重量份溶解，並加入含有 1000 ppm 乳化劑濃度的水直到得到所欲的濃度，製造一適合的活性成份調配物。將調配物以含有乳化劑的水稀釋，產生另外的試驗濃度。

將大白菜(*Brassica pekinensis*)葉盤噴灑上所欲濃度的活性成份調配物，及乾燥後，移入猿葉蟲(*Phaedon cochleariae*)的幼蟲。

7 天後，測定效力%。100%係指所有的甲蟲幼蟲皆被殺死；0%係指無任何的甲蟲幼蟲被殺死。

在此試驗中，例如，來自下列製備實例的化合物在 500 g/ha 的施用率時顯現 100%的效力：I-3、I-4、I-5。

秋行軍蟲(*Spodoptera frugiperda*)—噴灑試驗

溶劑： 78 重量份的丙酮

1.5 重量份的二甲基甲醯胺

乳化劑： 烷基芳基聚乙二醇醚

將 1 重量份的活性成份以所述的溶劑重量份溶解，並加入含有 1000 ppm 乳化劑濃度的水直到得到所欲的濃度，製造一適合的活性成份調配物。將調配物以含有乳化劑的水稀釋，產生另外的試驗濃度

將玉米(*Zea mays*)的葉盤噴灑上所欲濃度的活性成份調配物及，乾燥後，移入秋行軍蟲(*Spodoptera frugiperda*)的毛蟲。

7 天後，測定效力%。100%係指所有的毛蟲皆被殺死；0%係指無任何毛蟲被殺死。

在此試驗中，例如，來自下列製備實例的化合物在 500 g/ha 的施用率時顯現 100%的效力：I-3。

在此試驗中，例如，來自下列製備實例的化合物在 500 g/ha 的施用率時顯現 83%的效力：I-5。

二點葉蟬(*Tetranychus urticae*)—噴灑試驗 OP-抗性

溶劑： 78 重量份的丙酮

1.5 重量份的二甲基甲醯胺

乳化劑： 烷基芳基聚乙二醇醚

將 1 重量份的活性成份以所述的溶劑重量份溶解，並加入含有 1000 ppm 乳化劑濃度的水直到得到所欲的濃度，製造一適合的活性成份調配物。將調配物以含有乳化劑的水稀釋，產生另外的試驗濃度。

將經所有齡期的溫室紅蛛蟎 (*Tetranychus urticae*) 感染之菜豆 (*Phaseolus vulgaris*) 葉盤噴灑上所欲濃度的活性成份調配物。

6 天後，測定效力%。100%係指所有的蛛蟎皆被殺死；0%係指無任何蛛蟎被殺死。

在此試驗中，例如，來自下列製備實例的化合物在 500 g/ha 的施用率時顯現 70%的效力：I-5。

桃蚜(*Myzus persicae*)—噴灑試驗

溶劑： 14 重量份的二甲基甲醯胺

乳化劑： 烷基芳基聚乙二醇醚

將 1 重量份的活性成份以所述的溶劑重量份溶解，並加入含有 1000 ppm 乳化劑濃度的水直到得到所欲的濃度，製造一適合的活性成份調配物。將調配物以含有乳化劑的水稀釋，產生另外的試驗濃度。若需要加入銨鹽及/或滲透促進劑，則其各自係以 1000 ppm 之濃度加到此調配物溶液中。

將經綠桃蚜(*Myzus persicae*)重度感染的甜椒植株(*Capsicum annuum*)藉由噴灑上所欲濃度之活性成份調配物處理。

6 天後，測定死亡%。100%係指所有的蚜蟲皆被殺死；0%係指無任何蚜蟲被殺死。

在此試驗中，例如，來自下列製備實例的化合物在 20 ppm 的施用率時顯現 98%的效力：I-3。

【符號說明】

無

【生物材料寄存】

國內寄存資訊【請依寄存機構、日期、號碼順序註記】

無

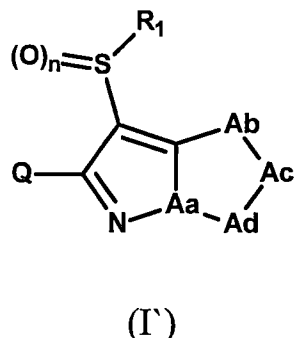
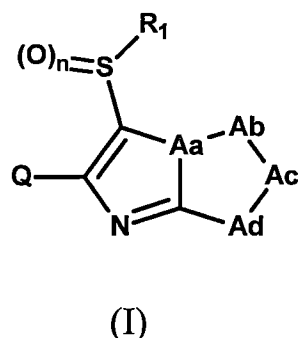
國外寄存資訊【請依寄存國家、機構、日期、號碼順序註記】

無

【序列表】(請換頁單獨記載) 無

申請專利範圍

1. 一種式(I)或(I')之化合物，



其中

Aa 為氮或  (帶有一連接 Ab 或 Ad 的雙鍵之碳原子)，

Ab 為=N-、-S(O)_m-、-O-、-N(R⁷)-、=C(R²)-或-C(R⁹)(R¹⁰)-，

Ac 為=N-、-S(O)_m-、-O-、-N(R⁷)-、=C(R³)-或-C(R¹¹)(R¹²)-，

Ad 為=N-、-S(O)_m-、-O-、-N(R⁷)-、=C(R⁸)-或-C(R¹³)(R¹⁴)-，

其中 Ab、Ac 或 Ad 取代基中僅有一個可為氧或-S(O)_m-，

R¹ 為(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)鹵烷基、(C₁-C₆)氰烷基、(C₁-C₆)羥烷基、
(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)鹵基烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)
烯基、(C₂-C₆)烯氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)鹵基烯氧基-(C₁-C₆)烷基、
(C₂-C₆)鹵烯基、(C₂-C₆)氰基烯基、(C₂-C₆)炔基、(C₂-C₆)炔氧基-(C₁-C₆)
烷基、(C₂-C₆)鹵基炔氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)鹵炔基、(C₂-C₆)氰基
炔基、(C₃-C₈)環烷基、(C₃-C₈)環烷基-(C₃-C₈)環烷基、(C₁-C₆)烷基
-(C₃-C₈)環烷基、鹵基(C₃-C₈)環烷基、胺基、(C₁-C₆)烷基胺基、二
-(C₁-C₆)烷基胺基、(C₃-C₈)環烷基胺基、(C₁-C₆)烷基羰基胺基、(C₁-C₆)
烷硫基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)鹵烷硫基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基亞磺
醯基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)鹵烷基亞磺醯基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基
磺醯基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)鹵烷基磺醯基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧

基-(C₁-C₆)烷基硫基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基亞磺醯基
-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基磺醯基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)
烷基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)鹵烷基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧
基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)鹵基烷氧基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)
烷基磺醯基胺基、胺基磺醯基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基胺基磺醯基
-(C₁-C₆)烷基、二-(C₁-C₆)烷基胺基磺醯基-(C₁-C₆)烷基，

或在各情況下視需要單一或多重地，相同或不同地為經芳基-、雜芳
基-或雜環基-取代的(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、(C₂-C₆)烯基、(C₂-C₆)
炔基、(C₃-C₈)環烷基，其中芳基、雜芳基或雜環基可各自視需要相
同或不同地經鹵素、氰基、硝基、羥基、胺基、羧基、胺甲醯基、
胺基磺醯基、(C₁-C₆)烷基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)
鹵烷基、(C₁-C₆)鹵基烷氧基、(C₁-C₆)烷基硫基、(C₁-C₆)烷基亞磺醯基、
(C₁-C₆)烷基磺醯基、(C₁-C₆)烷基硫亞胺基、(C₁-C₆)烷基硫亞胺基
-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基硫亞胺基-(C₂-C₆)烷基羰基、(C₁-C₆)烷基亞
磺亞胺基、(C₁-C₆)烷基亞磺亞胺基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基亞磺亞
胺基-(C₂-C₆)烷基羰基、(C₁-C₆)烷氧基羰基、(C₁-C₆)烷基羰基、(C₃-C₆)
三烷基矽基或苯甲基單-或多取代，或

R¹ 為芳基、雜芳基或雜環基，各自視需要相同或不同地經鹵素、氰
基、硝基、羥基、胺基、羧基、胺甲醯基、(C₁-C₆)烷基、(C₃-C₈)環
烷基、(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)鹵烷基、(C₁-C₆)鹵基烷氧基、(C₁-C₆)
烷基硫基、(C₁-C₆)烷基亞磺醯基、(C₁-C₆)烷基磺醯基、(C₁-C₆)烷基硫
亞胺基、(C₁-C₆)烷基硫亞胺基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基硫亞胺基
-(C₂-C₆)烷基羰基、(C₁-C₆)烷基亞磺亞胺基、(C₁-C₆)烷基亞磺亞胺基
-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基亞磺亞胺基-(C₂-C₆)烷基羰基、(C₁-C₆)烷氧

基羰基、(C₁-C₆)烷基羰基、(C₃-C₆)三烷基矽基、(=O) (僅限於雜環基的情況下)或(=O)₂(僅限於雜環基的情況下)單-或多取代，
R²、R³、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴ 獨立地為氫、氰基、鹵素、
硝基、乙醯基、羥基、胺基、SCN、三-(C₁-C₆)烷基矽基、(C₃-C₈)環
烷基、(C₃-C₈)環烷基-(C₃-C₈)環烷基、(C₁-C₆)烷基-(C₃-C₈)環烷基、鹵
基(C₃-C₈)環烷基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)鹵烷基、(C₁-C₆)氰烷基、(C₁-C₆)
羥烷基、羥基羰基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基-(C₁-C₆)烷基、
(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯基、(C₂-C₆)鹵烯基、(C₂-C₆)氰
基烯基、(C₂-C₆)炔基、(C₂-C₆)鹵炔基、(C₂-C₆)氰基炔基、(C₁-C₆)烷
氧基、(C₁-C₆)鹵基烷氧基、(C₁-C₆)氰基烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基
-(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷基羥基亞胺
基、(C₁-C₆)烷氧基亞胺基、(C₁-C₆)烷基-(C₁-C₆)烷氧基亞胺基、(C₁-C₆)
鹵烷基-(C₁-C₆)烷氧基亞胺基、(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)鹵烷硫基、
(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷硫基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)
烷基亞磺醯基、(C₁-C₆)鹵烷基亞磺醯基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基
亞磺醯基、(C₁-C₆)烷基亞磺醯基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基磺醯基、
(C₁-C₆)鹵烷基磺醯基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基磺醯基、(C₁-C₆)烷
基磺醯基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基磺醯基氧基、(C₁-C₆)烷基羰基、
(C₁-C₆)烷硫基羰基、(C₁-C₆)鹵烷基羰基、(C₁-C₆)烷基羰基氧基、(C₁-C₆)
烷氧基羰基、(C₁-C₆)鹵烷氧基羰基、胺基羰基、(C₁-C₆)烷基胺基羰
基、(C₁-C₆)烷基胺基硫羰基、二-(C₁-C₆)烷基胺基羰基、二-(C₁-C₆)
烷基胺基硫羰基、(C₂-C₆)烯基胺基羰基、二-(C₂-C₆)-烯基胺基羰基、
(C₃-C₈)環烷基胺基羰基、(C₁-C₆)烷基磺醯基胺基、(C₁-C₆)烷基胺基、
二-(C₁-C₆)烷基胺基、胺基磺醯基、(C₁-C₆)烷基胺基磺醯基、二-(C₁-C₆)

烷基胺基磺醯基、(C₁-C₆)烷基亞磺亞胺基、胺基硫羰基、(C₁-C₆)烷基胺基硫羰基、二-(C₁-C₆)烷基胺基硫羰基、(C₃-C₈)環烷基胺基或NHCO-(C₁-C₆)烷基 ((C₁-C₆)烷基羰基胺基)，

R⁷ 為氫、乙醯基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)羥烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)氰烷基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)烯氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)鹵基烯氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)鹵烯基、(C₂-C₄)氰基烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₂-C₄)炔氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)鹵基炔氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)鹵炔基、(C₂-C₄)氰基炔基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷基-(C₃-C₆)環烷基、鹵基(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷硫基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷硫基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷基亞磺醯基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基亞磺醯基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷基磺醯基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷基羰基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基羰基-(C₁-C₄)烷基，

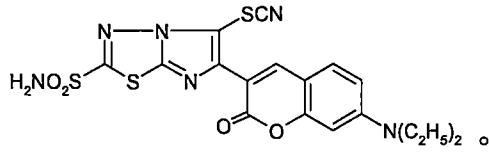
或在各情況下視需要單一或雙重、相同或不同地為經芳基-或雜環基-取代的(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)炔基，其中芳基或雜環基各自視需要單一或雙重、相同或不同地經鹵素、氰基、(C₁-C₄)烷基、(C₃-C₄)環烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基、(C₁-C₄)烷硫基、(C₁-C₄)烷基亞磺醯基或(C₁-C₄)烷基磺醯基取代，

Q 為部分飽和或飽和的雜環或雜芳香 8-、9-、10-、11-或 12-員稠合雙環或三環環系，其中可視需要存有至少一個羰基基團及/或其中該環系係視需要相同或不同地經單-或多取代，且其中取代基係獨立地選自氰基、鹵素、硝基、乙醯基、羥基、胺基、SCN、三-(C₁-C₆)烷基矽基、(C₃-C₈)環烷基、(C₃-C₈)環烷基-(C₃-C₈)環烷基、(C₁-C₆)烷基-(C₃-C₈)環烷基、鹵素(C₃-C₈)環烷基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)鹵烷基、

(C₁-C₆)氰烷基、(C₁-C₆)羧烷基、羧基羰基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)
烷氧基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯基、
(C₂-C₆)鹵烯基、(C₂-C₆)氰基烯基、(C₂-C₆)炔基、(C₂-C₆)炔氧基-(C₁-C₄)
烷基、(C₂-C₆)鹵炔基、(C₂-C₆)氰基炔基、(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)鹵
基烷氧基、(C₁-C₆)鹵基烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯氧基-(C₁-C₆)
烷基、(C₂-C₆)鹵基烯氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)氰基烷氧基、(C₁-C₆)
烷氧基羰基-(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)
烷基羧基亞胺基、(C₁-C₆)烷氧基亞胺基、(C₁-C₆)烷基-(C₁-C₆)烷氧基
亞胺基、(C₁-C₆)鹵烷基-(C₁-C₆)烷氧基亞胺基、(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)
鹵烷硫基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷硫基-(C₁-C₆)烷基、
(C₁-C₆)烷基亞磺醯基、(C₁-C₆)鹵烷基亞磺醯基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)
烷基亞磺醯基、(C₁-C₆)烷基亞磺醯基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基磺醯
基、(C₁-C₆)鹵烷基磺醯基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基磺醯基、(C₁-C₆)
烷基磺醯基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基磺醯基氧基、(C₁-C₆)烷基羰基、
(C₁-C₆)烷基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷硫基羰基、(C₁-C₆)鹵烷基羰
基、(C₁-C₆)烷基羰基氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基、(C₁-C₆)鹵基烷氧基
羰基、胺基羰基、(C₁-C₆)烷基胺基羰基、(C₁-C₆)烷基胺基硫羰基、
二-(C₁-C₆)烷基胺基羰基、二-(C₁-C₆)烷基胺基硫羰基、(C₂-C₆)烯基胺
基羰基、二-(C₂-C₆)-烯基胺基羰基、(C₃-C₈)環烷基胺基羰基、(C₁-C₆)
烷基磺醯基胺基、(C₁-C₆)烷基胺基、二-(C₁-C₆)烷基胺基、胺基磺醯
基、(C₁-C₆)烷基胺基磺醯基、二-(C₁-C₆)烷基胺基磺醯基、(C₁-C₆)烷
基亞磺亞胺基、胺基硫羰基、(C₁-C₆)烷基胺基硫羰基、二-(C₁-C₆)烷
基胺基硫羰基、(C₃-C₈)環烷基胺基、NHCO-(C₁-C₆)烷基 ((C₁-C₆)烷
基羰基胺基)，

或其中該取代基可獨立地選自苯基或 5-或 6-員雜芳香環，其中苯基或該環可視需要相同或不同地經 C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-環烷基、C₁-C₆-鹵烷基、C₂-C₆-鹵烯基、C₂-C₆-鹵炔基、C₃-C₆-鹵基環烷基、鹵素、CN、NO₂、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-鹵基烷氧基單-或多取代，

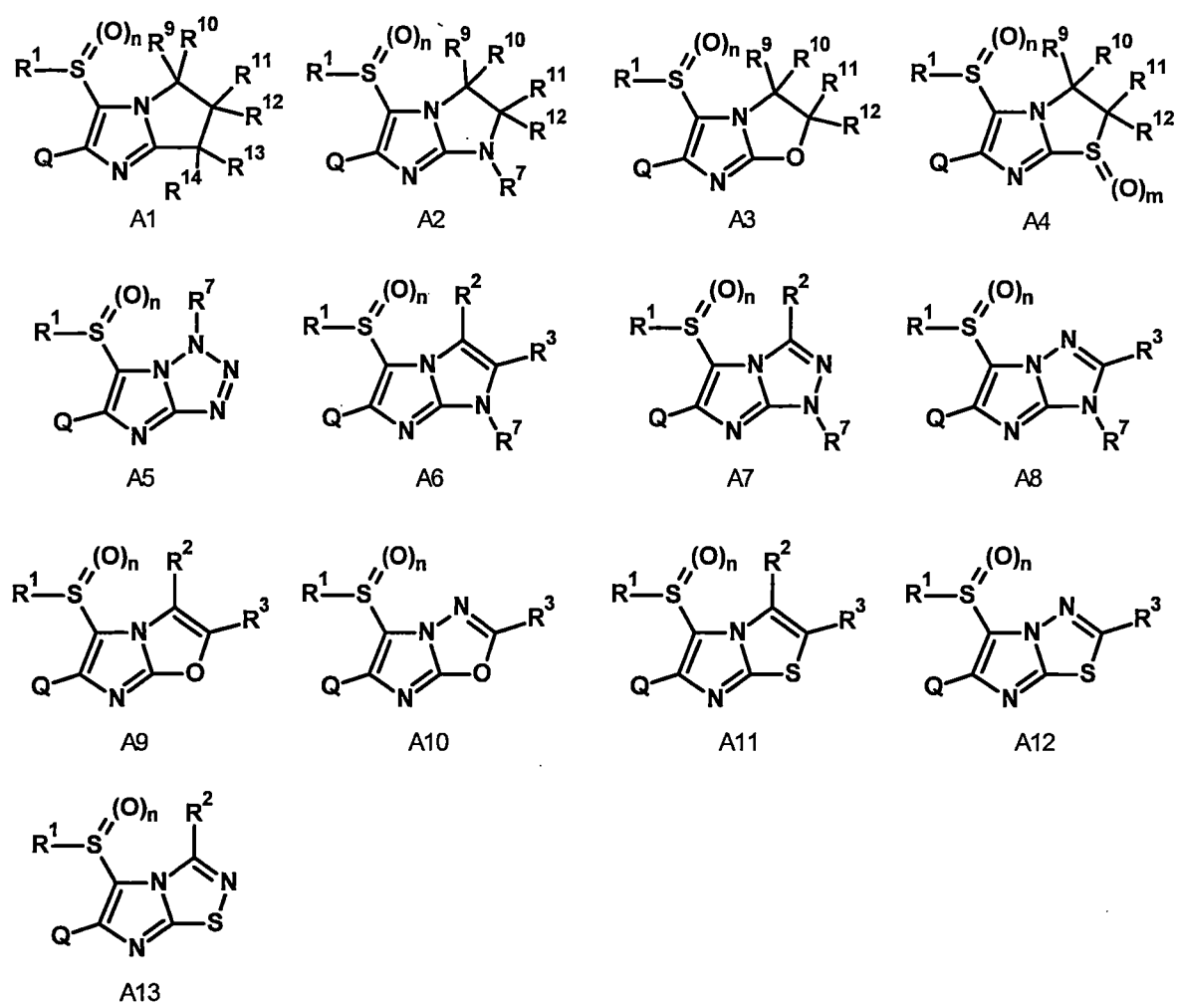
n 為 0、1 或 2，
m 為 0、1 或 2，不包括



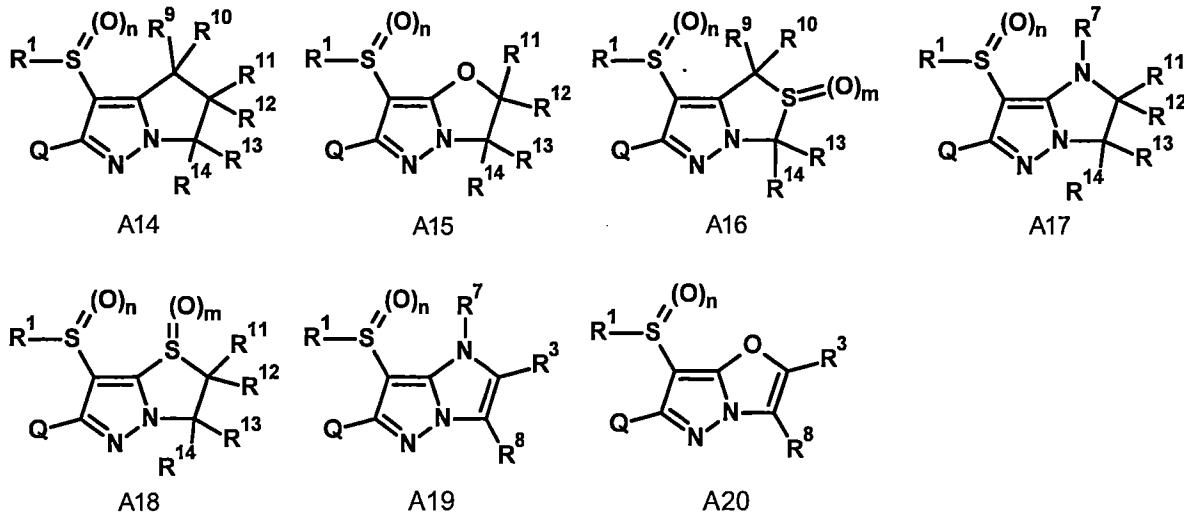
2. 根據請求項 1 之式(I)或(I')化合物，其中

Aa 為氮，
Ab 為=N-、-S(O)_m-、-O-、-N(R⁷)-、=C(R²)-或-C(R⁹)(R¹⁰)-，
Ac 為=N-、-S(O)_m-、=C(R³)-或-C(R¹¹)(R¹²)-，
Ad 為=N-、-S(O)_m-、-O-、-N(R⁷)-、=C(R⁸)-或-C(R¹³)(R¹⁴)-，
其中僅有其中一個 Ab、Ac 或 Ad 取代基可為氧或-S(O)_m-，
產生下列結構單元 A1 至 A20：

(I):



(I):



R¹ 為(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)經烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)鹵烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₂-C₄)鹵炔基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷硫基、(C₁-C₄)鹵烷硫基、(C₁-C₄)烷基亞磺醯基

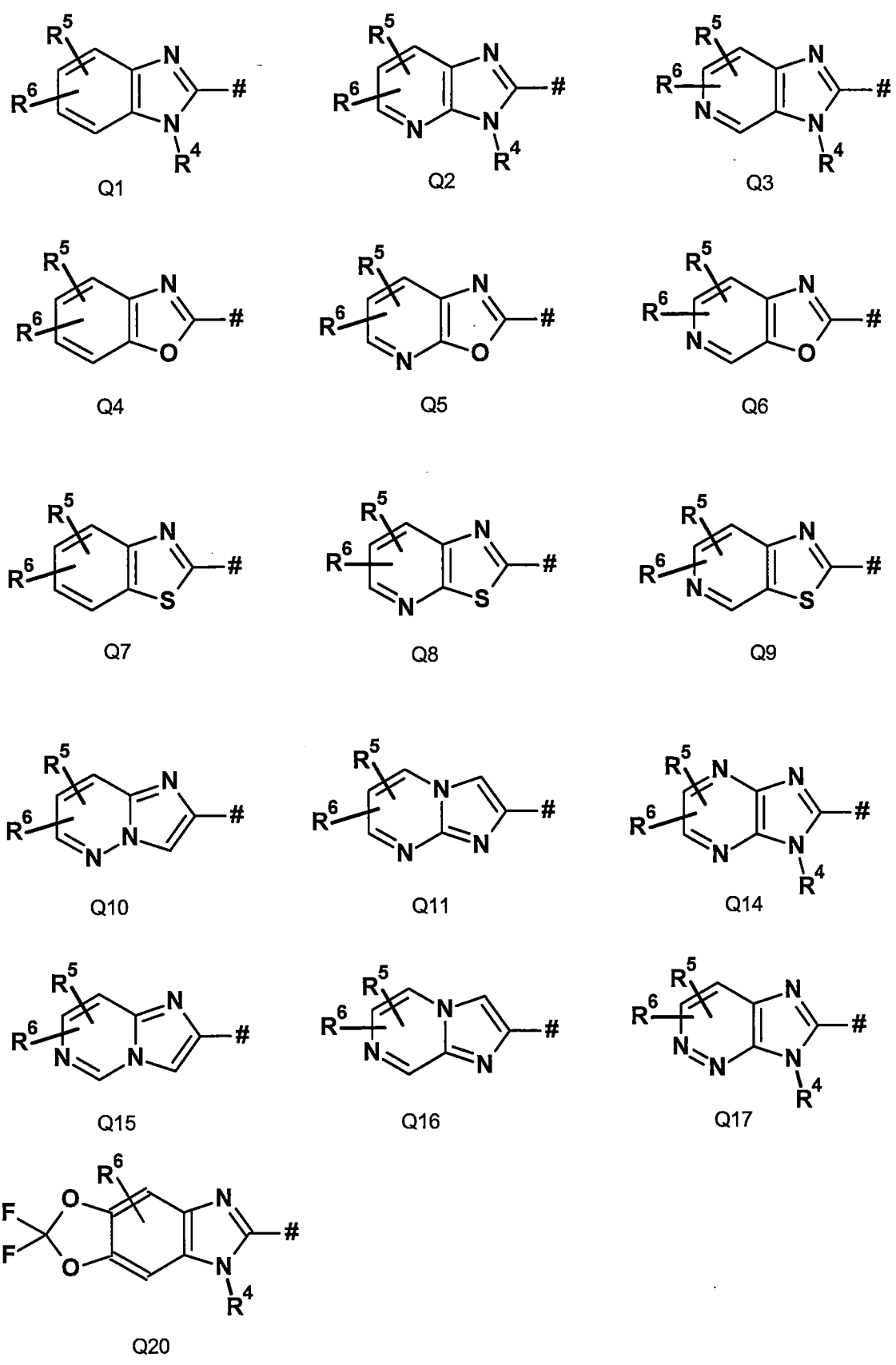
-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷基磺醯基-(C₁-C₄)烷基，
或在各情況下視需要單一或雙重、相同或不同地為經芳基-或雜環基
-取代的(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₃-C₆)環烷基，其
中各芳基或雜環基可各自視需要單一或雙重、相同或不同地經鹵素、
(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₃-C₄)環烷基、(C₁-C₄)烷氧基或(C₁-C₄)
烷硫基單-或多取代，或

R¹ 為芳基、雜芳基或雜環基，各自視需要相同或不同地經鹵素、氰
基、(C₁-C₄)烷基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷基、
(C₁-C₄)鹵基烷氧基、(C₁-C₄)烷硫基、(=O)(僅限於雜環基的情況下)
或(=O)₂(僅限於雜環基的情況下)單-或多取代，

R²、R³、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴ 獨立地為氫、氰基、鹵素、
硝基、羥基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷基-(C₃-C₆)環烷基、鹵基(C₃-C₆)
環烷基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)氰烷基、(C₁-C₄)烷氧
基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)鹵烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₂-C₄)
鹵炔基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基、(C₁-C₄)烷硫基、(C₁-C₄)
鹵烷硫基、(C₁-C₄)烷基亞磺醯基、(C₁-C₄)鹵烷基亞磺醯基、(C₁-C₄)
烷基磺醯基、(C₁-C₄)鹵烷基磺醯基、(C₁-C₄)烷基羰基、(C₁-C₄)鹵烷
基羰基、胺基羰基、(C₁-C₄)烷基胺基羰基、二-(C₁-C₄)烷基胺基羰基、
(C₁-C₄)烷基磺醯基胺基、(C₁-C₄)烷基胺基、二-(C₁-C₄)烷基胺基、胺
基磺醯基、(C₁-C₄)烷基胺基磺醯基、二-(C₁-C₄)烷基胺基磺醯基或
NHCO-(C₁-C₄)烷基 ((C₁-C₄)烷基羰基胺基)，

R⁷ 為氫、乙醯基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)氰烷基、(C₁-C₄)
烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₃-C₆)環烷基、
(C₁-C₄)烷基-(C₃-C₆)環烷基、鹵基(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷硫基

-(C₁-C₄)烷基，
或在各情況下視需要單一或雙重、相同或不同地為經芳基-或雜環基
-取代的(C₁-C₄)烷基，其中芳基或雜環基可各自視需要單一或雙重，
相同或不同地經鹵素、(C₁-C₄)烷基、氰基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)
鹵烷基或(C₁-C₄)鹵基烷氧基取代，
Q 為來自 Q1 至 Q11、Q14 至 Q17 或 Q20 基群之雜芳香 9-員或 12-
員稠合雙環或三環環系



R⁴ 為(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)氰烷基、(C₁-C₄)經烷基、
(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)
烯基、(C₂-C₄)烯氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)鹵基烯氧基-(C₁-C₄)烷基、

(C₂-C₄)鹵烯基、(C₂-C₄)氰基烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₂-C₄)炔氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)鹵炔基、(C₃-C₆)環烷基、(C₃-C₆)環烷基-(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷基-(C₃-C₆)環烷基、鹵基(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷硫基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷基亞磺醯基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷基磺醯基-(C₁-C₄)烷基或(C₁-C₄)烷基羰基-(C₁-C₄)烷基，

R⁵、R⁶獨立地為氫、氰基、鹵素、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)鹵烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₂-C₄)鹵炔基、(C₃-C₆)環烷基、(C₃-C₆)環烷基-(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷基-(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基、(C₁-C₄)烷氧基亞胺基、(C₁-C₄)烷硫基、(C₁-C₄)鹵烷硫基、(C₁-C₄)烷基亞磺醯基、(C₁-C₄)鹵烷基亞磺醯基、(C₁-C₄)烷基磺醯基、(C₁-C₄)鹵烷基磺醯基、(C₁-C₄)烷基磺醯基氧基、(C₁-C₄)烷基羰基、(C₁-C₄)鹵烷基羰基、胺基羰基、(C₁-C₄)烷基胺基羰基、二-(C₁-C₄)烷基胺基羰基、(C₁-C₄)烷基磺醯基胺基、(C₁-C₄)烷基胺基、二-(C₁-C₄)烷基胺基、胺基磺醯基、(C₁-C₄)烷基胺基磺醯基或二-(C₁-C₄)烷基胺基磺醯基，

n 為 0、1 或 2，

m 為 0、1 或 2。

3. 根據請求項 1 之式(I)或(I')化合物，其中

Aa 為氮，

Ab 為=N-、-O-、-N(R⁷)-或=C(R²)-，

Ac 為=N-或=C(R³)-，

Ad 為=N-、-S(O)_m-、-O-、-N(R⁷)-或=C(R⁸)-，

其中僅有一個 Ab 或 Ad 取代基可為氧或-S(O)_m-，

產生下列結構單元：A5、A6、A7、A8、A9、A10、A11、A12、A13、

A19、A20，

R^1 為(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基或(C₃-C₆)環烷基，

R^2 、 R^3 、 R^8 獨立地為氫、氰基、鹵素、硝基、羥基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷基-(C₃-C₆)環烷基、鹵基(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基、(C₁-C₄)烷硫基、(C₁-C₄)鹵烷硫基、(C₁-C₄)烷基亞磺醯基、(C₁-C₄)鹵烷基亞磺醯基、(C₁-C₄)烷基磺醯基、(C₁-C₄)鹵烷基磺醯基、胺基磺醯基、(C₁-C₄)烷基胺基磺醯基、二-(C₁-C₄)烷基胺基磺醯基或NHCO-(C₁-C₄)烷基 ((C₁-C₄)烷基羰基胺基)，

R^7 為氫、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)氰烷基或(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷基，

Q 為來自 Q1、Q2、Q3、Q4、Q5、Q6、Q8、Q9、Q10、Q15、Q17 基群之雜芳香 9-員稠合雙環環系，

R^4 為(C₁-C₄)烷基或(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷基，

R^5 為鹵素、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基或(C₁-C₄)鹵烷硫基，

R^6 為氫，

n 為 0、1 或 2，

m 為 0。

4. 根據請求項 1 之式(I)化合物，其中

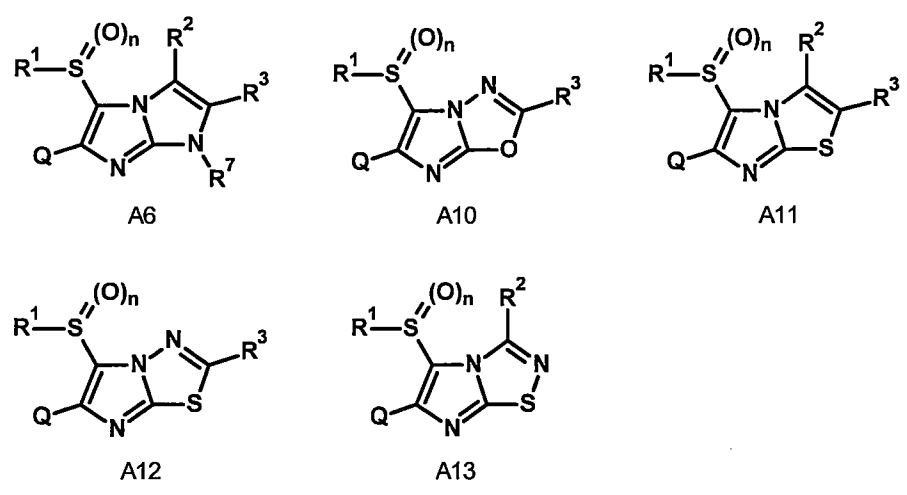
Aa 為氮，

Ab 為=N-或=C(R²)-，

Ac 為=N-或=C(R³)-，

Ad 為-S(O)_m-、-O-或-N(R⁷)-，

產生下列結構單元：A6、A10、A11、A12、A13，

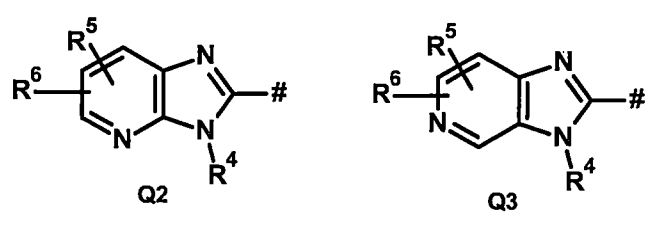


R¹ 為乙基，

R²、R³ 獨立地為氫、氟、氯、溴、碘、氰基、甲基、乙基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基或三氟甲基硫基，

R⁷ 為氫、甲基、乙基、正丙基、異丙基、第二丙基或第三丁基，

Q 為來自 Q2 或 Q3 基群之雜芳香 9-員稠合雙環環系



R⁴ 為甲基、乙基、異丙基、甲氧基甲基或甲氧基乙基，

R⁵ 為氟、氯、溴、一氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、一氟乙基(CH₂CFH₂、CHFCH₃)、二氟乙基(CF₂CH₃、CH₂CHF₂、CHFCHF₂)、三氟乙基(CH₂CF₃、CHFCHF₂、CF₂CHF₂)、四氟乙基(CHFCHF₃、CF₂CHF₂)、五氟乙基、三氟甲氧基、二氟一氯甲氧基、二氯一氟甲氧基或三氟甲硫基，

R⁶ 為氫，

n 為 0、1 或 2，

m 為 0。

5. 根據請求項 1 之式(I)化合物，其中

Aa 為氮，

Ab 為 $=C(R^2)-$ ，

Ac 為 $=C(R^3)-$ ，

Ad 為 $-S(O)_m-$ ，

產生下列結構單元：A11，

R^1 為乙基，

R^2 、 R^3 為氫，

Q 為來自 Q3 基團之雜芳香 9-員稠合雙環環系，

R^4 為甲基，

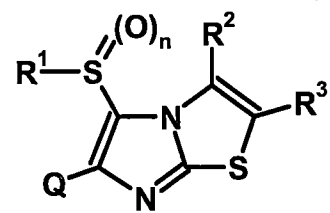
R^5 為三氟甲基，

R^6 為氫，

n 為 0 或 2，

m 為 0。

6. 根據請求項 1 之式(I)化合物，其帶有結構單元 A11



其中

Q 為 Q3 及

R^1 為 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 羧烷基、 (C_1-C_4) 鹵烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 鹵烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_2-C_4) 鹵炔基、 (C_3-C_6) 環烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 鹵烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基亞磺醯基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺醯基、 (C_1-C_4) 烷基，

或在各情況下視需要單一或雙重、相同或不同地為經芳基-或雜環基

-取代的(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₃-C₆)環烷基，其中芳基或雜環基可各自視需要單一或雙重，相同或不同地經鹵素、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₃-C₄)環烷基、(C₁-C₄)烷氧基或(C₁-C₄)烷硫基取代，或

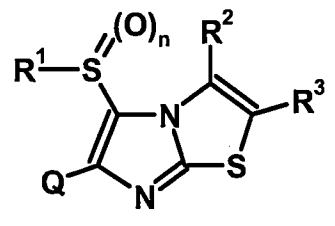
R¹ 為芳基、雜芳基或雜環基，各自視需要相同或不同地經鹵素、氰基、(C₁-C₄)烷基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基、(C₁-C₄)烷硫基、(=O)(僅限於雜環基的情況下)或(=O)₂(僅限於雜環基的情況下)單或雙取代，

R²、R³ 獨立地為氫、氰基、鹵素、硝基、羥基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷基、(C₃-C₆)環烷基、鹵基(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)氰烷基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)鹵烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₂-C₄)鹵炔基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基、(C₁-C₄)烷硫基、(C₁-C₄)鹵烷硫基、(C₁-C₄)烷基亞磺醯基、(C₁-C₄)鹵烷基亞磺醯基、(C₁-C₄)烷基磺醯基、(C₁-C₄)鹵烷基磺醯基、(C₁-C₄)烷基羰基、(C₁-C₄)鹵烷基羰基、胺基羰基、(C₁-C₄)烷基胺基羰基、二-(C₁-C₄)烷基胺基羰基、(C₁-C₄)烷基磺醯基胺基、(C₁-C₄)烷基胺基、二-(C₁-C₄)烷基胺基、胺基磺醯基、(C₁-C₄)烷基胺基磺醯基、二-(C₁-C₄)烷基胺基磺醯基或 NHCO-(C₁-C₄)烷基((C₁-C₄)烷基羰基胺基)，

R⁴ 為(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)氰烷基、(C₁-C₄)羥烷基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)烯氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)鹵基烯氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)鹵烯基、(C₂-C₄)氰基烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₂-C₄)炔氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)鹵炔基、(C₃-C₆)環烷基、(C₃-C₆)環烷基-(C₃-C₆)環烷基、

(C₁-C₄)烷基-(C₃-C₆)環烷基、鹵基(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷硫基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷基亞磺醯基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷基磺醯基-(C₁-C₄)烷基或(C₁-C₄)烷基羰基-(C₁-C₄)烷基，
R⁵、R⁶獨立地為氫、氰基、鹵素、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)鹵烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₂-C₄)鹵炔基、(C₃-C₆)環烷基、(C₃-C₆)環烷基-(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷基-(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基、(C₁-C₄)烷氧基亞胺基、(C₁-C₄)烷硫基、(C₁-C₄)鹵烷硫基、(C₁-C₄)烷基亞磺醯基、(C₁-C₄)鹵烷基亞磺醯基、(C₁-C₄)烷基磺醯基、(C₁-C₄)鹵烷基磺醯基、(C₁-C₄)烷基磺醯基氧基、(C₁-C₄)烷基羰基、(C₁-C₄)鹵烷基羰基、胺基羰基、(C₁-C₄)烷基胺基羰基、二-(C₁-C₄)烷基胺基羰基、(C₁-C₄)烷基磺醯基胺基、(C₁-C₄)烷基胺基、二-(C₁-C₄)烷基胺基、胺基磺醯基、(C₁-C₄)烷基胺基磺醯基或二-(C₁-C₄)烷基胺基磺醯基，
n 為 0、1 或 2。

7. 根據請求項 1 之式(I)化合物，其帶有結構單元 A11

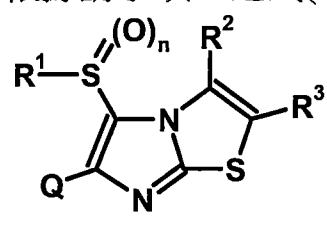


其中

Q 為 Q3 及
R¹ 為(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基或(C₃-C₆)環烷基，
R²、R³獨立地為氫、氰基、鹵素、硝基、羥基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷基-(C₃-C₆)環烷基、鹵基(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基、

(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷基亞磺醯基、(C₁-C₄)鹵烷基亞磺醯基、(C₁-C₄)烷基磺醯基、(C₁-C₄)鹵烷基磺醯基、胺基磺醯基、(C₁-C₄)烷基胺基磺醯基、二-(C₁-C₄)烷基胺基磺醯基或NHCO-(C₁-C₄)烷基((C₁-C₄)烷基羰基胺基)，
R⁴ 為(C₁-C₄)烷基或(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷基，
R⁵ 為鹵素、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)鹵基烷氧基或(C₁-C₄)鹵烷基，
R⁶ 為氫，
n 為 0、1 或 2。

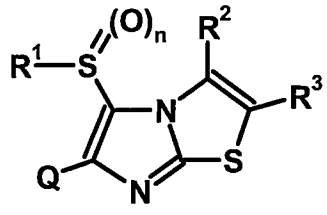
8. 根據請求項 1 之式(I)化合物，其帶有結構單元 A11



其中
Q 為 Q3 及
R¹ 為乙基，
R²、R³ 獨立地為氫、氟、氯、溴、碘、氰基、甲基、乙基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基或三氟甲硫基，
R⁴ 為甲基、乙基、異丙基、甲氧基甲基或甲氧基乙基，
R⁵ 為氟、氯、溴、一氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、一氟乙基(CH₂CFH₂、CHFCH₃)、二氟乙基(CF₂CH₃、CH₂CHF₂、CHFCHF₂)、三氟乙基(CH₂CF₃、CHFCHF₂、CF₂CFH₂)、四氟乙基(CHFCF₃、CF₂CHF₂)、五氟乙基、三氟甲氧基、二氟一氯甲氧基、二氯一氟甲氧基或三氟甲硫基，
R⁶ 為氫，

n 為 0、1 或 2。

9. 根據請求項 1 之式(I)化合物，其帶有結構單元 A11



其中

Q 為 Q3 及

R¹ 為乙基，

R² 為氫，

R³ 為氫或三氟甲基，

R⁴ 為甲基，

R⁵ 為三氟甲基，

R⁶ 為氫，

n 為 0 或 2。

10. 根據請求項 1 之式(I)化合物，其中

Aa 為氮，

Ab 為 -C(R⁹)(R¹⁰)-，

Ac 為 -C(R¹¹)(R¹²)-，

Ad 為 -C(R¹³)(R¹⁴)-，

產生下列結構單元：A1，

且 Q、R¹、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴ 和 n 係具有請求項 1 中所給予之定義。

11. 根據請求項 1 之式(I)化合物，其中

Aa 為氮，

Ab 為 $-C(R^9)(R^{10})-$ ，

Ac 為 $-C(R^{11})(R^{12})-$ ，

Ad 為 $-C(R^{13})(R^{14})-$ ，

產生下列結構單元：A1，

且 Q、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 和 n 係具有請求項 2 中所給予之定義。

12. 根據請求項 1 之式(I)化合物，其中

Aa 為氮，

Ab 為 $-C(R^9)(R^{10})-$ ，

Ac 為 $-C(R^{11})(R^{12})-$ ，

Ad 為 $-C(R^{13})(R^{14})-$ ，

產生下列結構單元：A1，

R^1 為 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 鹵烷基或 (C_3-C_6) 環烷基，

R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 獨立地為氫、 (C_1-C_4) 烷基或 (C_1-C_4) 鹵烷基，

Q 為來自 Q1、Q2、Q3、Q4、Q5、Q6、Q8、Q9、Q10、Q15、Q17 基群之雜芳香 9-員稠合雙環環系，

R^4 為 (C_1-C_4) 烷基或 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基，

R^5 為鹵素、 (C_1-C_4) 鹵烷基、 (C_1-C_4) 鹵基烷氧基或 (C_1-C_4) 鹵烷硫基，

R^6 為氫，

n 為 0、1 或 2。

13. 根據請求項 1 之式(I)化合物，其中

Aa 為氮，

Ab 為 $-C(R^9)(R^{10})-$ ，

Ac 為 $-C(R^{11})(R^{12})-$ ，

Ad 為 $-C(R^{13})(R^{14})-$ ，

產生下列結構單元：A1，

R^1 為乙基，

R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 獨立地為氫、甲基或乙基，

Q 為來自 Q2 或 Q3 基群之雜芳香 9-員稠合雙環環系，

R^4 為甲基、乙基、異丙基、甲氧基甲基或甲氧基乙基，

R^5 為氟、氯、溴、一氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、一氟乙基(CH_2CFH_2 、 $CHFCH_3$)、二氟乙基(CF_2CH_3 、 CH_2CHF_2 、 $CHFCFH_2$)、三氟乙基(CH_2CF_3 、 $CHFCHF_2$ 、 CF_2CFH_2)、四氟乙基($CHFCF_3$ 、 CF_2CHF_2)、五氟乙基、三氟甲氧基、二氟一氯甲氧基、二氯一氟甲氧基或三氟甲硫基，

R^6 為氫，

n 為 0、1 或 2。

14. 根據請求項 1 之式(I)化合物，其中

Aa 為氮，

Ab 為 $-C(R^9)(R^{10})-$ ，

Ac 為 $-C(R^{11})(R^{12})-$ ，

Ad 為 $-C(R^{13})(R^{14})-$ ，

產生下列結構單元：A1，

R^1 為乙基，

R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 為氫，

Q 為來自 Q3 基團之雜芳香 9-員稠合雙環環系，

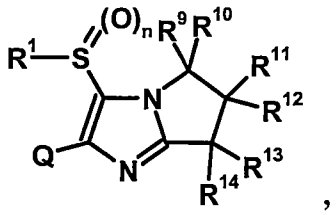
R^4 為甲基，

R^5 為三氟甲基，

R^6 為氫，

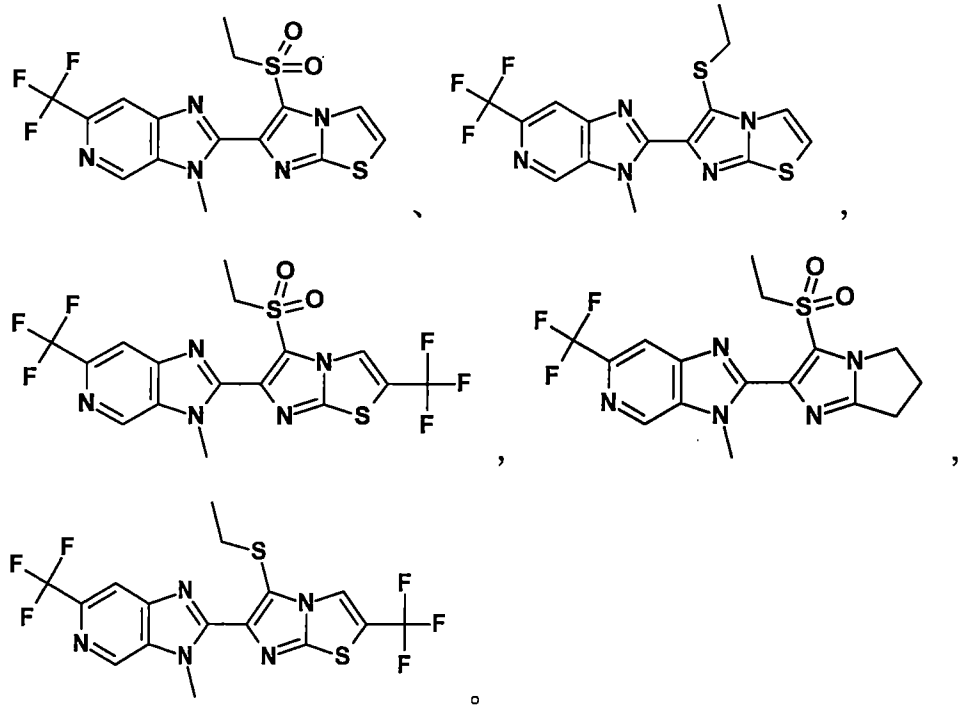
n 為 2。

15. 根據請求項 1 之式(I)化合物，其帶有結構單元 A1



其中 Q 為 Q3 而 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 和 n 係具有上述所給予之定義。

16. 根據請求項 1 之式(I)化合物，其係具有下列結構：



17. 一種農化品調配物，其係包含根據請求項 1 之式(I)或式(I')之化合物及擴增劑及/或介面活性劑。

18. 根據請求項 17 之農化品調配物，其額外地包含另一種活性農化成份。

19. 一種防治動物害蟲之方法，其特徵在於讓根據請求項 1 之式(I)或式(I')化合物或根據請求項 17 或 18 之農化品調配物得以作用在動物害

蟲上及/或其棲息地。

20. 一種根據請求項 1 之式(I)或式(I')化合物或根據請求項 17 或 18 之農
化品調配物的用途，其係用於防治動物害蟲。