I458725

(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公告本 **(11)證書號數：TW I458725 B**

(45)公告日： 中華民國 103 (2014) 年 11 月 01 日

(21)申請案號：102108167 (22)申請日： 中華民國 96 (2007) 年 03 月 30 日

(51)Int. Cl.： *C07D405/12 (2006.01)* *A01N43/40 (2006.01)*

A01P7/00 (2006.01) *A01P7/04 (2006.01)*

(30)優先權：2006/03/31 德國 10 2006 015 468.1

(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：趙 彼得 JESCHKE, PETER (DE)；文 羅伯 VELTEN, ROBERT (DE)；施 湯瑪 SCHENKE, THOMAS (DE)；施 歐圖 SCHALLNER, OTTO (DE)；巴 麥克 BECK, MICHAEL (DE)；馬 歐干 MALSAM, OLGA (DE)；那 洛夫 NAUEN, RALF (DE)；穆 湯瑪 MUELLER, THOMAS (DE)；安 克絲 ARNOLD, CHRISTIAN (DE)；施 艾奇 SANWALD, ERICH (DE)；高 尤奇 GOERGENS, ULRICH (DE)

(74)代理人：林秋琴；陳彥希；何愛文

(56)參考文獻：

EP 0539588A1 US 5744608

US 2006/0116519A1

審查人員：方冠岳

申請專利範圍項數：6 項 圖式數：0 共 79 頁

(54)名稱

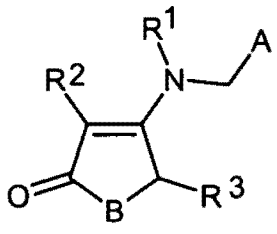
經取代之烯胺基羰基化合物

SUBSTITUTED ENAMINOCARBONYL COMPOUNDS

(57)摘要

本申請案係有關新穎之經取代之烯胺基羰基化合物、彼等之製備方法及彼等用於控制動物害蟲，尤其是節肢動物(特別是昆蟲)之用途。

The present application relates to novel substituted enaminocarbonyl compounds, to processes for their preparation and to their use for controlling animal pests, especially arthropods, in particular insects.



(I)

I458725

公告本

發明摘要

※ 申請案號：102108167 (由96111133分割)

※ 申請日：96.3.30

※IPC 分類：C07D 405/12 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)
A01P 7/00 (2006.01)
A01P 7/04 (2006.01)

【發明名稱】(中文/英文)

經取代之烯胺基羰基化合物

SUBSTITUTED ENAMINOCARBONYL COMPOUNDS

【中文】

本申請案係有關新穎之經取代之烯胺基羰基化合物、彼等之製備方法及彼等用於控制動物害蟲，尤其是節肢動物 （特別是昆蟲）之用途。

【英文】

The present application relates to novel substituted enaminocarbonyl compounds, to processes for their preparation and to their use for controlling animal pests, especially arthropods, in particular insects.

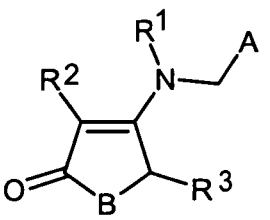
【代表圖】

【本案指定代表圖】：無

【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)

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）

經取代之烯胺基羰基化合物

SUBSTITUTED ENAMINOCARBONYL COMPOUNDS

【技術領域】

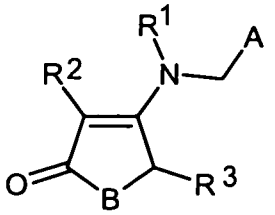
本申請案係有關新穎之經取代之烯胺基羰基化合物、彼等之製備方法及彼等用於控制動物害蟲，尤其是節肢動物，特別是昆蟲，之用途。

【先前技術】

經取代之烯胺基羰基化合物已知為殺昆蟲活性化合物（參見 EP 0 539 588 A1，DE 102004047922 A1）。

【發明內容】

本發明現提供新穎之式(I)化合物



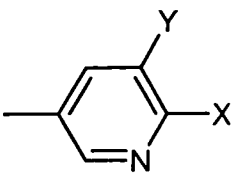
(I)

其中

A 代表基團嘧啶基、吡唑基、噻吩基、噁唑基、異噁唑基、1,2,4-噁二唑基、異噻唑基、1,2,4-三唑基或 1,2,5-噻二唑基之一，彼等選擇性地經氟、氯、溴、氰基、硝基、C_1-C_4-烷基（其選擇性被氟及／或氯取代）、C_1-C_3-烷硫基（其選擇性被氟及／或氯取代）或 C_1-C_3-烷基磺醯基（其選擇性被氟及／或氯取代），

或

A　代表一基團



其中

X 代表鹵素、烷基或鹵烷基，

Y 代表鹵素、烷基、鹵烷基、鹵烷氧基、疊氮基或氰基，

B　代表氧、硫或亞甲基，

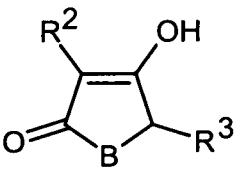
R^1　代表鹵烷基、鹵烯基、鹵環烷基或鹵環烷基烷基，

R^2　代表氫或鹵素，及

R^3　代表氫或烷基。

又，現已發現到新穎之式(I)化合物係當

a)　式(II)化合物



(II)

其中

B、R^2 及 R^3 為如上述定義

與式(III)化合物

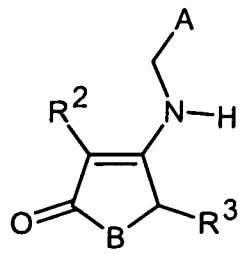
$$HN(R^1)\text{-}CH_2\text{-}A \qquad (III)$$

其中

A 及 R^1 為如上述定義

進行反應（若適當，在一適當稀釋劑之存在下及若適當在一種酸性輔助劑（方法 1）之存在下）時，或當

b)　式(I)化合物



(Ia)

其中

A、B、R^2及R^3為如上述定義

與式(IV)化合物

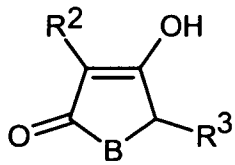
$$E\text{-}R^1 \quad (IV)$$

其中

E 代表一適當離去基，諸如鹵素（特別是溴、氯、碘）或O-磺醯基烷基及O-磺醯基芳基（特別是O-甲磺醯基、O-甲苯磺醯基）

進行反應（若適當，在一適當稀釋劑之存在下及若適當在一種酸性接受劑（方法2）之存在下）時，或當

c) 式(II)化合物



(II)

其中

B、R^2及R^3為如上述定義

在第一反應步驟中與式(V)化合物

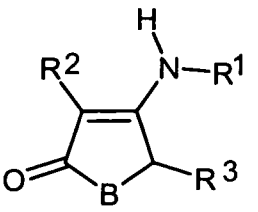
$$H_2N\text{-}R^1 \quad (V)$$

其中

R^1為如上述定義

進行反應（若適當，在一適當稀釋劑之存在下及若適當在一種酸性輔助劑之存在下），及

將形成之式(VI)化合物



(VI)

其中

B、R^1、R^2及R^3為如上述定義

隨後在第二反應步驟中，與式(VII)化合物

$$E\text{-}CH_2\text{-}A \quad (VII)$$

其中

E及A為如上所定義

進行反應（若適當，在一適當稀釋劑之存在下及若適當在一種酸性接受劑(方法3)之存在下）時所獲得。

最後，現已發現到，新穎之式(I)化合物具有非常明顯的生物特性且特別適合用於控制動物害蟲，特別是在農業中、在森林中、在貯存產品之保護中及在物質之保護中以及在衛生領域中所遭遇到之昆蟲、蛛形綱動物及線蟲類。

若適當，視取代基之性質而定，式(I)化合物可以幾何及／或光學活性異構物或不同組成物之對應的異構物混合物形式存在。本發明亦有關純的異構物及異構物混合物。

式(I)提供根據本發明之化合物的一般定義。

前文及後文所述諸式中之較佳的取代基或基團範圍被詳細說明如下。

A　較佳代表嘧啶-5-基，其在2-位置上選擇性被鹵素或C_1-C_4-烷基所取代；代表1*H*-吡唑-4-基，其在1-位置上選擇性被C_1-C_4-烷基所

取代及其在 3-位置上選擇性被鹵素所取代；代表 1*H*-吡唑-5-基，其在 2-位置上選擇性被鹵素或 C_1-C_4-烷基所取代；代表異㗁唑-5-基，其在 3-位置上選擇性被鹵素或 C_1-C_4-烷基所取代；代表 1,2,4-㗁二唑-5-基，其在 3-位置上選擇性被鹵素或 C_1-C_4-烷基所取代；代表 1-甲基-1,2,4-三唑-3-基或代表 1,2,5-噻二唑-3-基。

此外

A 代表基團 5,6-二氟吡啶-3-基、5-氯-6-氟吡啶-3-基、5-溴-6-氟吡啶-3-基、5-碘-6-氟吡啶-3-基、5-氟-6-氯吡啶-3-基、5,6-二氯吡啶-3-基、5-溴-6-氯吡啶-3-基、5-碘-6-氯吡啶-3-基、5-氟-6-溴吡啶-3-基、5-氯-6-溴吡啶-3-基、5,6-二溴吡啶-3-基、5-碘-6-溴吡啶-3-基、5-氟-6-碘吡啶-3-基、5-氯-6-碘吡啶-3-基、5-溴-6-碘吡啶-3-基、5,6-二碘吡啶-3-基、5-甲基-6-氟吡啶-3-基、5-甲基-6-氯吡啶-3-基、5-甲基-6-溴吡啶-3-基、5-甲基-6-碘吡啶-3-基、5-二氟甲基-6-氟吡啶-3-基、5-二氟甲基-6-氯吡啶-3-基、5-二氟甲基-6-溴吡啶-3-基或 5-二氟甲基-6-碘吡啶-3-基之一。

B 較佳代表氧或亞甲基。

R^1 較佳代表分別經氟取代之 C_1-C_5-烷基、C_2-C_5-烯基、C_3-C_5-環烷基或 C_3-C_5-環烷基烷基。

R^2 較佳代表氫或鹵素

R^3 較佳代表氫或 C_1-C_3-烷基。

A 特佳代表基團 2-甲基嘧啶-5-基、2-氯嘧啶-5-基、1*H*-吡唑-4-基（其在 1-位置上選擇性被甲基、乙基所取代及其在 3-位置上被氯所取代）、1*H*-吡唑-5-基，2-甲基吡唑-5-基、2-溴噻唑基、異㗁唑-5-基（其在 3-位置上選擇性被甲基、乙基、氯或溴所取代）、3-甲基-1,2,4-㗁二唑-5-基、1-甲基-1,2,4-三唑-3-基或 1,2,5-噻二唑-3-基之

一，

此外

A　特佳代表基團 5-氟-6-氯吡啶-3-基、5,6-二氯吡啶-3-基、5-溴-6-氯吡啶-3-基、5-氟-6-溴吡啶-3-基、5-氯-6-溴吡啶-3-基、5,6-二溴吡啶-3-基、5-甲基-6-氯吡啶-3-基、或 5-甲基-6-溴吡啶-3-基之一。

B　特佳代表氧或亞甲基。

R^1　特佳代表 2-氟乙基、2,2-二氟乙基或 2-氟環丙基。

R^2　特佳代表氫、氟、氯或溴。

R^3　特佳代表氫或甲基。

A　極佳代表基團 2-甲基嘧啶-5-基、2-氯嘧啶-5-基、3-甲基異噁唑-5-基、3-溴異噁唑-5-基、5-氟-6-氯吡啶-3-基、5,6-二氯吡啶-3-基或 5-氟-6-溴吡啶-3-基之一，

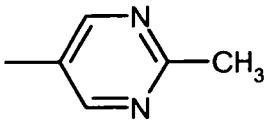
B　極佳代表氧。

R^1　極佳代表 2,2-二氟乙基。

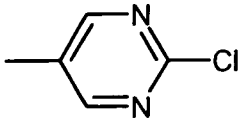
R^2　特佳代表氫。

R^3　特佳代表氫。

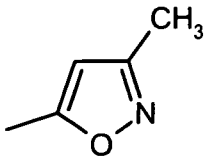
於一特殊組群之式(I)化合物中，A 代表 2-甲基嘧啶-5-基，



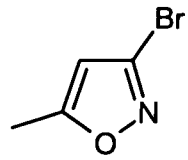
於又一特殊組群之式(I)化合物中，A 代表 2-氯嘧啶-5-基，



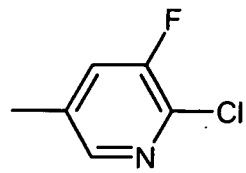
於又一特殊組群之式(I)化合物中，A 代表 3-甲基異噁唑-5-基，



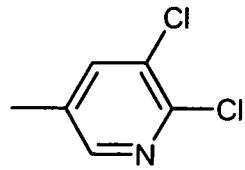
於又一特殊組群之式(I)化合物中，A 代表 3-溴異噁唑-5-基，



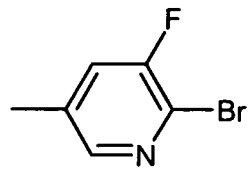
於又一特殊組群之式(I)化合物中，A 代表 5-氟-6-氯吡啶-3-基，



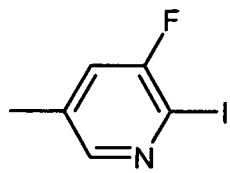
於又一特殊組群之式(I)化合物中，A 代表 5,6-二氯吡啶-3-基，



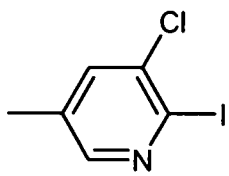
於又一特殊組群之式(I)化合物中，A 代表 5-氟-6-溴吡啶-3-基，



於又一特殊組群之式(I)化合物中，A 代表 5-氟-6-碘吡啶-3-基，



於又一特殊組群之式(I)化合物中，A 代表 5-氯-6-碘吡啶-3-基，

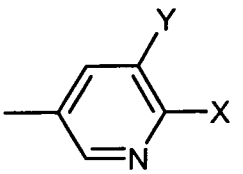


下文中，定義另一組群之較佳的式(I)化合物，其中

A　代表嘧啶-5-基，其在 2-位置上被鹵素或鹵基-C_1-C_4-烷基所取代，

或

A 代表一基團



其中

X 代表鹵素、C_1-C_4-烷基或鹵基-C_1-C_4-烷基，

Y 代表鹵素、鹵基-C_1-C_4-烷基、鹵基-C_1-C_4-烷氧基、疊氮基或氰基，

B 代表氧、硫或亞甲基，

R^1 代表鹵基-C_1-C_3-烷基、鹵基-C_2-C_3-烯基、鹵基環丙基（其中鹵素特別代表氟或氯），

R^2 代表氫或鹵素及

R^3 代表氫或甲基，

A 較佳代表 2-氯嘧啶-5-基或 2-三氟甲基嘧啶-5-基，

此外

A 較佳代表基團 5,6-二氟吡啶-3-基、5-氯-6-氟吡啶-3-基、5-溴-6-氟吡啶-3-基、5-碘-6-氟吡啶-3-基、5-氟-6-氯吡啶-3-基、5,6-二氯吡啶-3-基、5-溴-6-氯吡啶-3-基、5-碘-6-氯吡啶-3-基、5-氟-6-溴吡啶-3-基、5-氯-6-溴吡啶-3-基、5,6-二溴吡啶-3-基、5-氟-6-碘吡啶-3-基、5-氯-6-碘吡啶-3-基、5-溴-6-碘吡啶-3-基、5-甲基-6-氟吡啶-3-基、5-甲基-6-氯吡啶-3-基、5-甲基-6-溴吡啶-3-基、5-甲基-6-碘吡啶-3-基、5-二氟甲基-6-氟吡啶-3-基、5-二氟甲基-6-氯吡啶-3-基、5-二氟甲基-6-溴吡啶-3-基、5-二氟甲基-6-碘吡啶-3-基之一。

B 較佳代表氧或亞甲基。

R^1 較佳代表分別經氟取代之 C_1-C_3-烷基、C_2-C_3-烯基或環丙基。

R^2 較佳代表氫或鹵素（其中鹵素特別代表氟或氯）

R^3 較佳代表氫。

A 特佳代表基團 2-氯嘧啶-5-基、5-氟-6-氯吡啶-3-基、5,6-二氯吡啶-3-基、5-溴-6-氯吡啶-3-基、5-氟-6-溴吡啶-3-基、5-氯-6-溴吡啶-3-基、5,6-二溴吡啶-3-基、5-甲基-6-氯吡啶-3-基、5-氯-6-碘吡啶-3-基或5-二氟甲基-6-氯吡啶-3-基之一。

B 特佳代表氧。

R^1 特佳代表 2-氟乙基、2,2-二氟乙基或 2-氟環丙基。

R^2 特佳代表氫。

R^3 特佳代表氫。

A 極佳代表 5-氟-6-氯吡啶-3-基或 5-氟-6-溴吡啶-3-基。

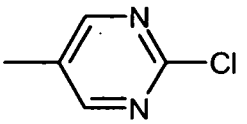
B 極佳代表氧。

R^1 極佳代表 2,2-二氟乙基。

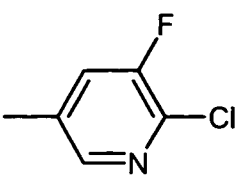
R^2 特佳代表氫。

R^3 特佳代表氫。

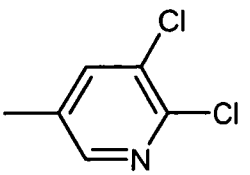
於一特殊組群之式(I)化合物中，R^3 代表氫，B 代表氧及 A 代表 2-氯嘧啶-5-基，



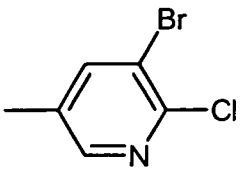
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^3 代表氫，B 代表氧及 A 代表 5-氟-6-氯吡啶-3-基，



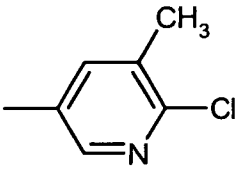
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^3代表氫，B 代表氧及 A 代表 5,6-二氯吡啶-3-基，



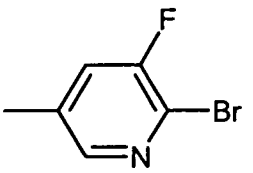
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^3代表氫，B 代表氧及 A 代表 5-溴-6-氯吡啶-3-基，



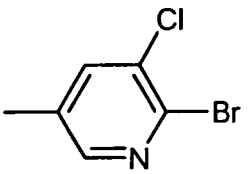
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^3代表氫，B 代表氧及 A 代表 5-甲基-6-氯吡啶-3-基，



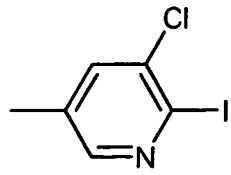
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^3代表氫，B 代表氧及 A 代表 5-氟-6-溴吡啶-3-基，



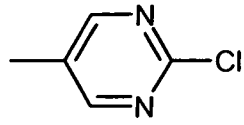
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^3代表氫，B 代表氧及 A 代表 5-氯-6-溴吡啶-3-基，



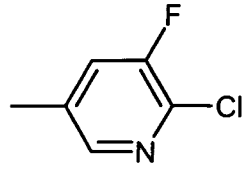
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^3代表氫，B 代表氧及 A 代表 5-氯-6-碘吡啶-3-基，



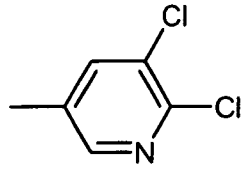
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^3 代表氫，B 代表氧及 A 代表 2-氯嘧啶-5-基，



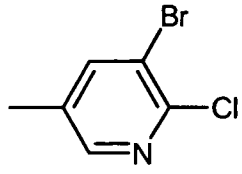
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^2 及 R^3 代表氫，B 代表氧及 A 代表 5-氟-6-氯吡啶-3-基，



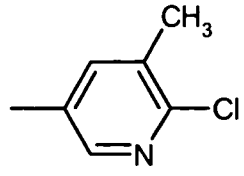
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^2 及 R^3 代表氫，B 代表氧及 A 代表 5,6-二氯吡啶-3-基，



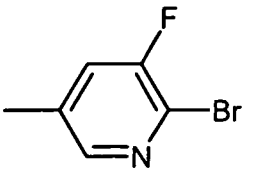
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^2 及 R^3 代表氫，B 代表氧及 A 代表 5-溴-6-氯吡啶-3-基，



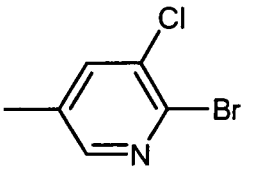
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^2 及 R^3 代表氫，B 代表氧及 A 代表 5-甲基-6-氯吡啶-3-基，



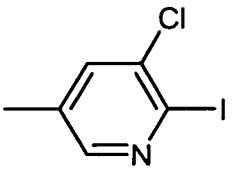
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^2及R^3代表氫，B 代表氧及 A 代表 5-氟-6-溴吡啶-3-基，



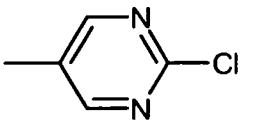
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^2及R^3代表氫，B 代表氧及 A 代表 5-氯-6-溴吡啶-3-基，



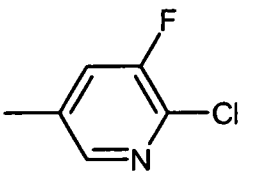
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^2及R^3代表氫，B 代表氧及 A 代表 5-氯-6-碘吡啶-3-基，



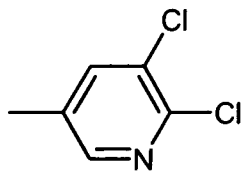
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^2及R^3代表氫，B 代表亞甲基及 A 代表 2-氯嘧啶-5-基，



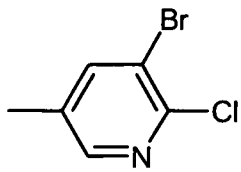
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^2及R^3代表氫，B 代表亞甲基及 A 代表 5-氟-6-氯吡啶-3-基，



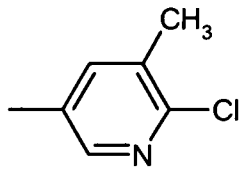
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^2及R^3代表氫，B 代表亞甲基及 A 代表 5,6-二氯吡啶-3-基，



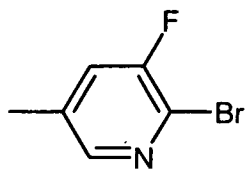
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^2 及 R^3 代表氫，B 代表亞甲基及 A 代表 5-溴-6-氯吡啶-3-基，



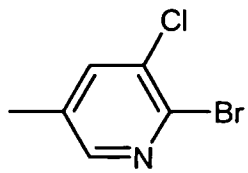
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^2 及 R^3 代表氫，B 代表亞甲基及 A 代表 5-甲基-6-氯吡啶-3-基，



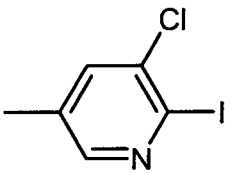
於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^2 及 R^3 代表氫，B 代表亞甲基及 A 代表 5-氟-6-溴吡啶-3-基，



於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^2 及 R^3 代表氫，B 代表亞甲基及 A 代表 5-氯-6-溴吡啶-3-基，



於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^2 及 R^3 代表氫，B 代表亞甲基及 A 代表 5-氯-6-碘-吡啶-3-基，



於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^1代表二氟甲基，R^2及R^3代表氫及 B 代表氧。

於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^1代表 2-氟乙基，R^2及R^3代表氫及 B 代表氧。

於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^1代表 2,2-二氟乙基，R^2及R^3代表氫及 B 代表氧。

於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^1代表二氟甲基，R^2及R^3代表氫及 B 代表亞甲基。

於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^1代表 2-氟乙基，R^2及R^3代表氫及 B 代表亞甲基。

於又一特殊組群之式(I)化合物中，R^1代表 2,2-二氟乙基，R^2及R^3代表氫及 B 代表亞甲基。

以上之一般或較佳之基團定義或說明適用於末端產品及對應之先質及中間體。此等基團定義視需要互相組合，包括各別較佳範圍之間的組合。

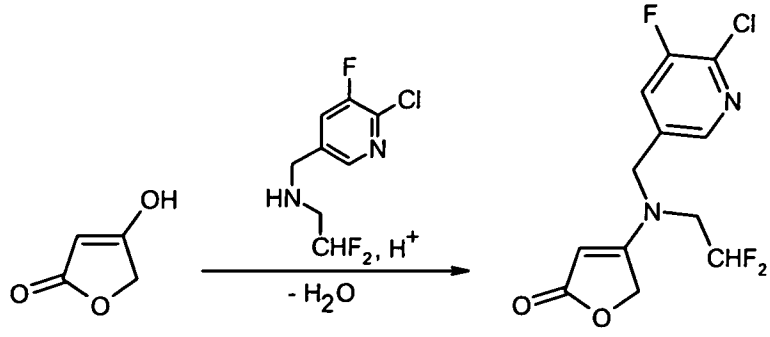
根據本發明較佳者為包含上述為較佳意義之組合之式(I)化合物。

根據本發明特佳者為包含上述為特佳意義之組合之式(I)化合物。

根據本發明極佳者為包含上述為極佳意義之組合之式(I)化合物。

於根據本發明製備新穎之式(I)化合物之方法 1 中，若式(II)化合物為例如特窗酸(tetronic acid)，及式(III)化合物為例如 N-[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基]-2,2-二氟乙烷-1-胺，則製備方法 1 可藉以下之反應流程 I 代表：

流程 I



式(II)提供為進行根據本發明之方法 1 所需要之一般定義之化合物作為起始物質。

於此式(II)中，B、R^2 及 R^3 較佳代表那些關於根據本發明之式(I)化合物之說明中已被述及為較佳取代基之基團。

一些式(II)化合物可自商業上或藉來自文獻之已知方法予以獲得（參見例如，通式(II)之化合物，其中 B 代表氧：特窗酸（Said, A.特用化學品雜誌(1984)，4(4)，7-8；Rao, Y. S. Chem. Rev. (1976), 76, 625-694；Tejedor, D. ； Garcia-Tellado, F. Org. Preparations and Procedures International (2004), 36, 35-59；Review）；通式(II)之化合物，其中 B 代表硫：硫特窗酸（Thomas, E. J. Special Publication-Royal Society of Chemistry (1988), 65 (Top. Med. Chem.), 284-307, Review），通式(II)之化合物，其中B代表亞甲基：環戊烷-1,3-二酮(Schick, Hans；Eichhorn, Inge, Synthesis (1989), (7), 477-492, Review）。

式(III)提供為進行根據本發明之方法 1 其他被用作起始物質之一般定義之化合物。

於式(III)中，A 及 R^1 具有關於根據本發明之式(I)化合物之說明中已被述及之意義。

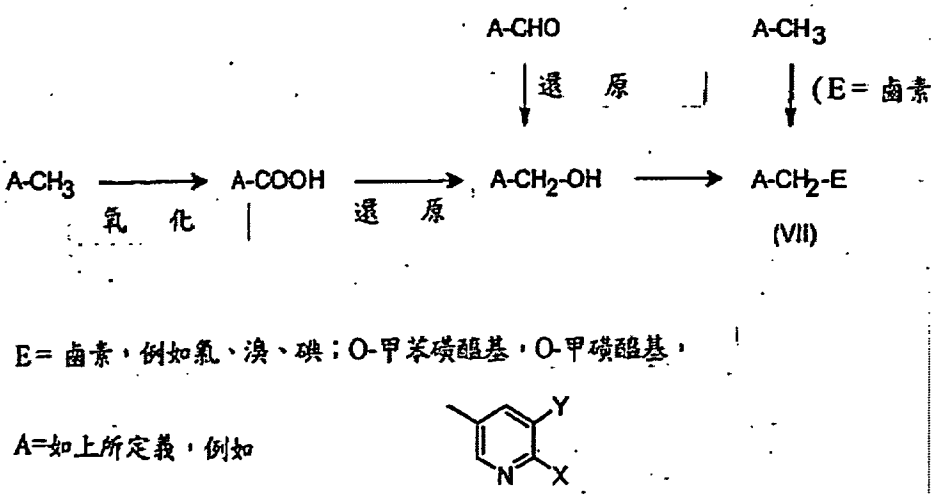
一些式(III)化合物可自商業上或藉來自文獻之已知方法予以獲得

（參見例如，S. Patai 之"胺基之化學"，Interscience Publishers, 紐約，1968；通式(III)之化合物，其中 R^1 代表氫：一級胺，通式(III)之化合物，其中 R^1 代表鹵烷基、鹵烯基或鹵環烷基：二級胺）。

一些式(VII)化合物為商業上可取得，部分為已知或可藉已知方法獲得。

製備式(VII)化合物之路徑被描述於反應流程 III 中。

流程 III



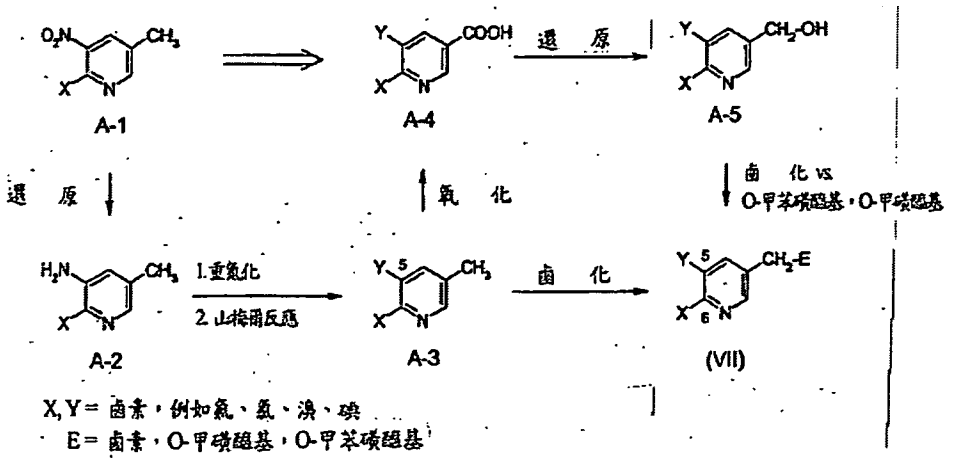
例如經甲基-取代之化合物(A-CH_3)可藉氧化予以轉變成對應之羧酸（A-COOH，例如 5-氟-6-溴菸鹼酸：F. L. Setliff, G.O. Rankin, J. Chem. Eng. Data (1972), 17, 515-516；5-氯-6-溴菸鹼酸及 5,6-二溴菸鹼酸：F. L. Setliff 等人, J. Chem. Eng. Data (1981), 26, 332-333；5-碘-6-溴菸鹼酸：F. L. Setliff 等人, J. Chem. Eng. Data (1978), 23, 96-97，5-氟-6-碘菸鹼酸及 5-氯-6-碘菸鹼酸：F. L. Setliff, J. E. Lane J. Chem. Eng. Data (1976), 21, 246-247 或羧酸酯（例如甲基 5-甲基-6-氟菸鹼酸鹽：WO 9833772 A1，1998；甲基 5-甲基-6-溴菸鹼酸鹽：WO 9730032，1997）。

羧酸(A-COOH)隨後可藉文獻中已知的方法予以轉變成對應之羥

甲基化合物(A-CH_2-OH)，其隨後藉文獻中已知的方法進行反應，獲得活化之羥甲基化合物（A-CH_2-E，E = O-甲苯磺醯基，O-甲磺醯基）或鹵甲基化合物（A-CH_2-E，E = Hal）。後者亦可包含甲基之對應化合物(A-CH_3)，利用文獻上已知之適當的鹵化劑予以獲得。以下之化合物的合成：5-氯甲基-5-溴-6-氯吡啶，3-溴-5-碘-6-氯吡啶（S. Kagabu 等人，J. Pestic. Sci. (2005)，30，409-413）可被提及作為此程序之實例。

式(VII)之化合物，其中 A 代表 5,6-二取代之吡啶-3-基亦可藉文獻上已知之方法獲得。文獻上已知之適當之起始物質例如為 6-鹵基-取代之 5-硝基-β-甲吡啶(A-1)，其可藉已知之文獻程序予以修飾，如反應流程 IV 中所示。

流程 IV



6-鹵基-取代之 5-硝基-β-甲吡啶(A-1)之還原例如提供 6-鹵基-取代之 5-胺基-β-甲吡啶（A-2，例如 5-胺基-6-氯-β-甲吡啶及 5-胺基-6-溴-β-甲吡啶：Setliff, F. L. Org. Preparations and Preparations Int. (1971), 3, 217-222；Kagabu, S 等人，J. Pestic. Sci. (2005), 30, 409-413）。後續之重氮化反應及山梅爾(Sandmeyer)反應（C. F. H. Alien, J. R. Thirtle, Org. Synth.，Coll. Vol. HI, 1955, p. 136）允許導入在 5 位置上之鹵素取代（A-3，例如 5-氟-6-氯-β-甲吡啶及 5-氟-6-溴-β-甲吡啶：Setliff, F. L. Org.

Preparations and Preparations Int. (1971), 3, 217-222；5-碘-6-氯-β-甲吡啶：Kagabu, S.等人，J. Pestic. Sci. (2005), 30, 409- 413；5,6-二氯甲吡啶：Setliff, F. L.；Lane, J. E. J. Chem. Engi- neering Data (1976), 21, 246-247)。在 5,6-二取代之 β-甲吡啶(A-3)上之甲基之氧化形成對應之 5,6-二取代之菸鹼酸（A-4，例如 5-氟-6-氯菸鹼酸及 5-氟-6-溴菸鹼酸：Setliff F. L., Rankin G. O. J. Chem. Engineering Data (1972), 17, 515-516；5-溴-6-氟菸鹼酸、5-溴-6-氯菸鹼酸及 5-溴-6-溴菸鹼酸：F. L. Setliff J. Chem. Engineering Data (1970), 15, 590-591；5-氯-6-溴菸鹼酸及 5-碘-6-溴菸鹼酸：Setliff, F. L., Greene, J. S. J. Chem. Engineering Data (1978), 23, 96-97；亦已知者為 5-氯-6-三氟甲基菸鹼酸：F. Cottet et al., Synthesis (2004), 10, 1619- 1624)，其可在還原劑之存在下被轉變成對應之羥甲基化之吡啶(A-5)（例如 5-溴-6-氯-3-羥甲基吡啶：Kagabu, S. 等人，J. Pestic. Sci. (2005), 30, 409-413)。

藉 6-氯-5-硝基菸鹼酸（A-4，X=C1，$Y=NO_2$；Boyer, J. H.; Schoen, W., J. Am. Chem. Soc. (1956), 78, 423-425）之還原，可形成 6-氯-3-羥甲基-5-硝基吡啶(A-5，X=C1, $Y=NO_2$； Kagabu, S.等人，J. Med. Chem. (2000), 43, 5003-5009)，其隨後可被還原成 6-氯-3-羥甲基-5-胺基吡啶（A-5，X=C1，$Y=NH_2$；Kagabu, S.等人，J. Med. Chem. (2000), 43, 5003-5009)及藉由重氮化及與羥胺之反應予以轉變成 6-氯-3-羥甲基-5-疊氮吡啶(A-5，X=C1, $Y=N_3$；Kagabu, S.等人，J. Med. Chem. (2000), 43, 5003-5009)。後續以硫醯氯之鹵化獲得 6-氯-3-氯甲基-5-疊氮吡啶（VII，X=C1, $Y=N_3$，E=Cl；Kagabu, S.等人，J. Med. Chem. (2000), 43, 5003-5009)。

另外，在(A-3)之 3-位置上之甲基的鹵化獲得式(VII)之化合物，其中 E 代表鹵素（例如：3-溴甲基-6-氯-5-氟吡啶，3-溴甲基-6-氯-5-碘吡啶：Kagabu, S.等人，J. Pestic. Sci. (2005), 30, 409-413)。當使用 6-鹵基

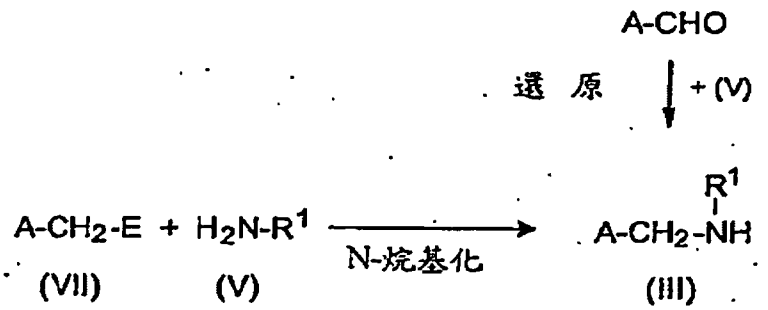
-取代之 5-硝基-β-甲吡啶（A-3；$Y=NO_2$）時，在 3 位置上有初始之甲基鹵化（例如 3-溴甲基-6-氯-5-硝基-吡啶：Kagabu, S.等人，J. Pestic. Sci. (2005), 30, 409-413）。若適當，硝基亦可在反應順序之較後階段被還原。

亦可由文獻獲知的是在式(VII)化合物（其中 E 代表 N-嗎啉基）之 5-位置上取代基之導入（例如 $Y=N_3$）。此基團隨後可被鹵素(E=Hal)極容易地置換（參見 S. Kagabu 等人，J. Med. Chem. 2000, 43, 5003-5009；反應條件：氯甲酸乙酯，四氫呋喃，60℃）。

通常，亦可以其他鹵素原子或鹵化基團（例如三氟甲基）置換吡啶氮附近之鹵素原子（轉鹵化，例如：氯以溴或碘置換；溴以碘或氟置換；碘以氟或三氟甲基置換）。因此，其他替代之合成路徑必須交換吡啶-5-基之 6-位置上之鹵素原子（例如 X=Cl）（例如 A-4，其中 X, Y=Cl；5,6-二氯菸鹼酸：Setliff, F. L.; Lane, J. E. J. Chem. Engineering Data (1976), 21, 246-247）為另一種鹵素原子，例如碘或氟（例如：A-4，其中 X=I；5-溴-6-碘菸鹼酸及 A-4，其中 X=F；5-溴-6-氟菸鹼酸：Setliff, F. L.；Price, D. W. J. Chem. Engineering Data (1973), 18, 449-450）。然而，此種轉鹵化若適當亦可稍後在適當之式(I)化合物中進行，如在反應流程 X 及以下藉由操作實施例所述者。

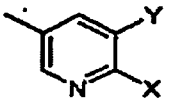
為製備式(III)化合物，例如式(VII)化合物（其中 A 及 E 具有上述之意義）與式(V)化合物（其中 R^1 具有上述之意義）反應，若適當在稀釋劑之存在下及若適當在製備方法 2 之說明中（參見 N-烷基化，流程 V）所述之鹼性反應輔助劑之存在下。

流程 V



E= 鹵素，例如氯、溴、碘；O-甲苯磺醯基，O-甲磺醯基

A=如上所定義，例如



於某些情況中，亦可另外由對應之醛(A-CHO)及式(V)化合物藉還原反應製備式(III)化合物(參見 Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie [有機化學之方法]，vol. XI/1，Georg Thieme Berlag Stuttgart, p. 602)。

通常，有利的是在稀釋劑之存在下進行根據本發明之製備方法 1。稀釋劑有利地以使反應混合物在整個過程中仍容易攪拌之用量來使用。進行根據本發明之方法 1 之適當的稀釋劑為所有之惰性有機溶劑。

可提及之實例為：鹵化烴類，特別是氯化烴，諸如四氯乙烯、四氯乙烷、二氯丙烷、氯甲烷、二氯丁烷、氯仿、四氯化碳、三氯乙烷、三氯乙烯、五氯乙烷、二氟苯、1,2-二氯乙烷、氯苯、溴苯、二氯苯、氯甲苯、三氯苯；醇類，諸如甲醇、乙醇、異丙醇、丁醇；醚類，諸如乙基丙醚、甲基第三丁醚、正丁醚、茴香醚、苯乙醚、環己基甲醚、二甲醚、二乙醚、二丙醚、二異丙醚、二-正-丁醚、二異丁醚、二異戊醚、乙二醇二甲醚、四氫呋喃、二噁烷、二氯二乙醚及氧化乙烯及／或氧化丙烯之聚醚；胺類，諸如三甲胺、三乙胺、三丙胺、三丁胺、N-甲基嗎啉、吡啶及四亞甲基二胺；硝化烴類，諸如硝基甲烷、硝基乙烷、硝基丙烷、硝基苯、氯硝基苯、鄰-硝基苯；腈類，諸如乙腈、

丙腈、丁腈、異丁腈、苄腈、間-氯苄腈，以及化合物，諸如二氧化四氫噻吩及二甲基亞碸、四亞甲基亞碸、二丙基亞碸、苄基甲基亞碸、二異丁基亞碸、二丁基亞碸、二異戊基亞碸；碸類，諸如二甲碸、二乙碸、二丙碸、二丁碸、二苯碸、二己碸、甲乙碸、乙基丙碸、乙基異丁碸及五亞甲基碸；脂族、環脂族或芳香族烴，諸如戊烷、己烷、庚烷、辛烷、壬烷及工業用烴類（例如含有具沸點在例如 40℃至 250℃之成分的石油溶劑）、異丙甲苯、具有 70℃至 190℃沸點間隔之石油餾分、環己烷、甲基環己烷、石油醚、輕汽油、辛烷、苯、甲苯、氯苯、溴苯、硝基苯、二甲苯；酯類，諸如甲基乙酸酯、乙基乙酸酯、丁基乙酸酯、異丁基乙酸酯以及二甲基碳酸酯、二丁基碳酸酯、乙烯碳酸酯；醯胺類，諸如六亞甲基磷酸三醯胺、甲醯胺、*N*-甲基甲醯胺、*N,N*-二甲基甲醯胺、*N,N*-二丙基甲醯胺、*N,N*-二丁基甲醯胺、*N*-甲基吡咯啶酮、*N*-甲基己內醯胺、1,3-二甲基-3,4,5,6-四氫-2(1H)-嘧啶、辛基吡咯啶酮、辛基己內醯胺、1,3-二甲基-2-咪唑啉二酮、*N*-甲醯基哌啶、*N,N'*-1,4-二甲醯基哌𠯿；酮類，諸如丙酮、苯乙酮、甲乙酮、甲丁酮。

亦可使用所述供根據本發明方法之溶劑及稀釋劑之混合物。

惟，實施根據本發明方法之較佳稀釋劑為芳香族烴類，諸如苯、甲苯、氯苯、溴苯、硝基苯或二甲苯，特別是苯及甲苯。

根據製備方法 1 之式(I)化合物之製備通常係藉於稀釋劑中之酸性輔助劑之存在下將式(II)化合物與式(III)化合物反應來進行。

反應時間通常為 10 分鐘至 48 小時。

反應係在介於-10℃和+200℃之間，較佳介於+10℃和 180℃之間，特佳介於 20℃和 140℃之間的溫度下進行。反應較佳在使水被分離或被移除（例如藉助水分離器或藉添加適當之分子篩，其使水被去除）之反應條件下實施。

原則上，反應係在大氣壓力下進行。反應較佳在大氣壓力或在至

多達 15 巴之壓力下，及若適當在保護氣體（氮、氦或氬氣）之氛圍下進行。

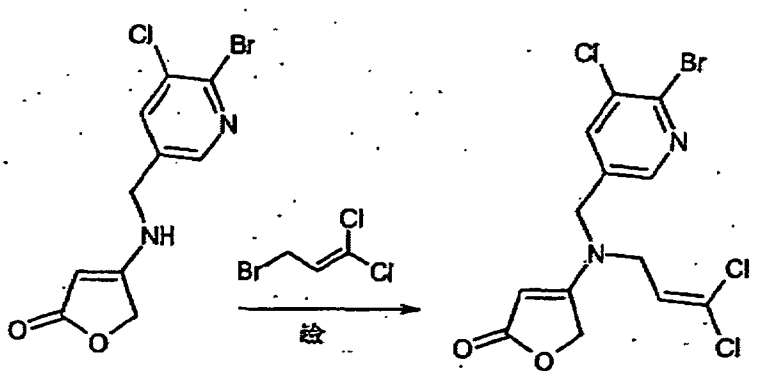
為實施根據本發明方法 1，每莫耳式(II)化合物通常使用 0.5 至 4.0 莫耳，較佳 0.7 至 3.0 莫耳，特佳 1.0 至 2.0 莫耳之式(III)之胺基化合物。

此外，為實施根據本發明方法 1，通常添加催化劑量之酸性輔助劑。適當之酸性輔助劑例如為對-甲苯磺酸或乙酸。

於反應已進行完全之後，濃縮整個反應混合物。在收集之後所獲得之產物可依傳統方式，藉再結晶、於減壓下蒸餾或管柱層析予以純化（亦參見製備實施例）。

於製備新穎之式(I)化合物之根據本發明之方法 2 中，若式(Ia)化合物為例如 4-[[(6-溴-5-氯吡啶-3-基)甲基]胺基]呋喃-2(5H)-酮及式(IV)化合物為 1-溴-1,1-二氯丙-1-烯者，則製備方法 2 可藉以下之反應流程 VI 表示：

流程 VI



式(Ia)提供為進行根據本發明之方法 2 所需要之一般定義之化合物作為起始物質。

於此式(Ia)中，A、B、R^2 及 R^3 較佳代表那些關於根據本發明之式(I)化合物之說明中已被述及為較佳取代基之基團。

式(Ia)化合物可藉製備方法 1 予以獲得（進一步如上述），例如藉反應式(II)化合物與式(III)化合物（其中 R^1 代表氫）而成。

式(IV)提供為進行根據本發明之方法 2 進一步被使用作為起始物

質之一般定義之化合物。

於式(IV)中，E 及 R^1 具有關於根據本發明之式(I)化合物之說明中已被述及之意義。

一些式(IV)化合物為商業上可取得，或彼等可藉文獻上已知方法獲得（參見例如，1-溴-1,1-二氯丙烯：WO 8800183 Al (1988)；式(IV)化合物，其中 E 代表鹵素，諸如氯、溴及碘：Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, vol. V/3, Georg Thieme Verlag Stuttgart, p. 503 and vol. V/4 p. 13, 517；式(IV)化合物，其中 E 代表甲磺醯基：Crossland, R. K., Servis, K. L. J. Org. Chem. (1970), 35, 3195；式(IV)化合物，其中 E 代表甲苯磺醯基：Roos, A. T.等人，Org. Synth., Coll. Vol. I, (1941), 145; Marvel, C. S., Sekera, V. C. Org. Synth., Coll. Vol. III, (1955), 366。

通常，有利的是在稀釋劑之存在下，若適當，在鹼性輔助劑之存在下實施根據本發明之製備方法 2。

稀釋劑有利地以使反應混合物在整個過程中仍容易攪拌之用量來使用。進行根據本發明之方法 2 之適當的稀釋劑為所有之惰性有機溶劑。

實施根據本發明方法 2 之較佳稀釋劑為醚類，諸如甲基第三-丁醚、正-丁醚、茴香醚、苯乙醚、環己基甲醚、二異丙醚、二異丁醚、二異戊醚、乙二醇二甲醚、四氫呋喃、二噁烷、二氯二乙醚及氧化乙烯及／或氧化丙烯之聚醚；醯胺類，諸如六亞甲基磷酸三醯胺、甲醯胺、*N*-甲基甲醯胺、*N,N*-二甲基甲醯胺、*N,N*-二丙基甲醯胺、*N,N*-二丁基甲醯胺；芳香族烴類，諸如 *N*-甲基苯、甲苯、氯苯、溴苯、硝基苯、二甲苯；酮類，諸如丙酮、苯乙酮、甲乙酮或甲丁酮。

亦可使用所述供根據本發明方法 2 之溶劑及稀釋劑之混合物。

惟，實施根據本發明方法 2 之較佳稀釋劑為醚類，諸如甲基第三-丁醚或環醚，諸如四氫呋喃及二噁烷；醯胺類，諸如 *N,N*-二甲基甲醯胺，芳香族烴類，諸如苯或甲苯；酮類，諸如丙酮、甲乙酮或甲丁酮。

適合用作實施根據製備方法 2 之鹼性反應輔助劑者為所有適合之酸性黏結劑，特別是第三胺，以及鹼金屬及鹼土金屬化合物。

可提及之實例為鋰、鈉、鉀、鎂、鈣及鋇之氫氧化物，氫化物、氧化物及碳酸鹽，以及其他鹼性化合物，諸如脒鹼或胍鹼，諸如 7-甲基-1,5,7-三氮雙環[4.4.0]癸-5-烯(MTBD)；二氮雙環[4.3.0]壬烯(DBN)、二氮雙環[2.2.2]辛烷(DABCO)、1,8-二氮雙環[5.4.0]十一烯(DBU)、環己基四丁基胍(CyTBG)、環己基四甲基胍(CyTMG)、N,N,N,N-四甲基-1,8-萘二胺、五甲基哌啶、第三胺（諸如三乙胺、三甲胺、三苄胺、三異丙胺、三丁胺、三環己胺、三戊胺、三己胺、*N,N*-二甲基苯胺、*N,N*-二甲基甲苯胺、*N,N*-二甲基-對-胺基吡啶、*N*-甲基吡咯啶酮、*N*-甲基哌啶、*N*-甲基咪唑、*N*-甲基吡唑、*N*-甲基嗎啉、*N*-甲基六亞甲基二胺、吡啶、4-吡咯啶並吡啶、4-二甲基胺基吡啶、喹啉、α-甲吡啶、β-甲吡啶、異喹啉、嘧啶、吖啶、*N,N,N',N'*-四亞甲基二胺、*N,N,N',N'*-四亞乙基二胺、N-丙基二異丙胺、N-乙基二異丙胺、*N,N'*-二甲基-環己基胺、2,6-二甲吡啶、2,4-二甲吡啶或三乙基二胺）。

較佳為使用鋰或鈉之氫化物。

反應時間通常為 10 分鐘至 48 小時。

反應係在介於-10℃和+200℃之間，較佳介於+10℃和 180℃之間，特佳介於 60℃和 140℃之間的溫度下進行。原則上，反應係在大氣壓力下或在至多達 15 巴之壓力下，及若適當在保護氣體（氮、氦或氬氣）之氛圍下進行。

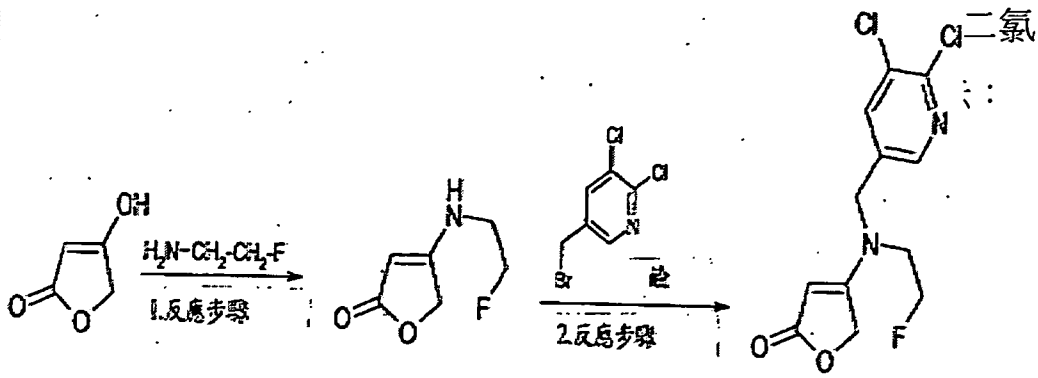
為實施根據本發明方法 2，每莫耳式(II)化合物通常使用 0.5 至 4.0 莫耳，較佳 0.7 至 3.0 莫耳，特佳 1.0 至 2.0 莫耳之通式(IV)之烷化劑。

於反應已進行完全之後，濃縮整個反應混合物。在收集之後所獲得之產物可依傳統方式，藉再結晶、於減壓下蒸餾或管柱層析予以純化（亦參見製備實施例）。

於製備新穎之式(I)化合物之根據本發明之方法 3 中，若於第一反

應步驟中所使用之式(II)化合物為例如特窗酸且式(V)化合物為 2-氟乙胺氯化物，及於第二反應步驟中，通式(VI)之形成化合物為 4-[(2-氟乙基)胺基]-3-(2,3-二氯吡啶-4-基)-1H-吡咯-2-酮。

流程 V



式(II)提供為進行根據本發明之方法 3 所需要之一般定義之化合物作為起始物質且已更詳細地被描述於上述之方法 1 中。

式(V)提供為進行根據本發明之方法 3 進一步被使用作為起始物質之一般定義之化合物。

於式(V)中，R^1 具有關於根據本發明之通式(I)化合物之說明中已被述及之意義。

式(V)之胺基化合物以一般方式予以定義且於許多情況中，彼等部分為商業上可取得，或彼等可依本身已知方式藉魯卡-瓦勒奇(Leuckart-Wallach)反應獲得（例如 2-氟乙胺：US-Pat. 4030994 (1977)；通式 V 化合物，其中 R^1 代表烷基、一級胺：參見例如 Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, vol. XI/1, 4. Ed. 1957, G. Thieme Verlag, Stuttgart, p. 648；M. L. Moore 於"魯卡反應"：有機反應，第 5 冊，第 2 版，1952，紐約，約翰威里父子公司，倫敦）。

通常，有利的是在稀釋劑之存在下實施根據本發明之製備方法 3。稀釋劑有利地以使反應混合物在整個過程中仍容易攪拌之用量來使用。進行根據本發明之方法 3 之適當的稀釋劑為所有之惰性有機溶劑。

實施根據本發明方法 3 之較佳稀釋劑為芳香族烴類，諸如苯、甲苯、氯苯、溴苯、硝基苯或二甲苯，特別是苯及甲苯。

於第二反應步驟中，式(VI)化合物藉式(VII)化合物予以 N-烷基化。

通常，有利的是在稀釋劑之存在下及在鹼性反應輔助劑之存在下實施根據本發明之製備方法 3 之第二反應步驟。

稀釋劑有利地以使反應混合物在整個過程中仍容易攪拌之用量來使用。進行根據本發明之方法 3 之適當的稀釋劑為所有之惰性有機溶劑。

供第二反應步驟之適當的稀釋劑為例如醚類，諸如四氫呋喃或二噁烷。

供第二反應步驟之適當的鹼性反應輔助劑為強鹼，諸如氫化鈉。

反應時間通常為 10 分鐘至 48 小時。

反應係在介於-10℃和+200℃之間，較佳介於+10℃和 180℃之間，特佳介於 60℃和 140℃之間的溫度下進行。反應較佳在使水被分離或被移除（例如藉助水分離器）之反應環境下實施。

於反應已進行完全之後，濃縮整個反應混合物。在收集之後所獲得之產物可依傳統方式，藉再結晶、於減壓下蒸餾或管柱層析予以純化（亦參見製備實施例）。

若適當，式(I)化合物可以不同多形態形式或為不同多形態形式之混合物存在。純的多形態及多形態混合物為本發明所提供且可根據本發明予以使用。

併有良好之植物耐受性及對溫血動物之適宜的毒性且為環境可忍受之根據本發明之活性化合物適合供保護植物及植物器官、供增加收穫物產量、供改良收穫物質之量及供控制動物害蟲，特別是在農業、園藝、畜牧業、森林、花園及休閒設施中，在貯存產物及物質之保護方面及在衛生領域中會遭遇到的昆蟲、蛛形綱動物、寄生蟲、線蟲及軟體動物。彼等在對抗一般為敏感及具抵抗性之物種及對抗所有或部分生長階段為具有活性。上述之害蟲包括：

蝨目(毛蝨目)，例如牛羽蝨(Damalinia)屬、血蝨(Haema- topinus)屬、毛蝨(Linognathus)屬、蝨(Pediculus)屬、鬚毛蝨(Trichodectes)屬 。

蛛形綱(Arachnida)，例如粗足粉蟎(Acarus siro)、桔瘤節蜱(Aceria sheldoni)、癭蟎(Aculops)屬、節蜱(Aculus)屬、花蜱(Amblyomma)屬、銳緣蜱(Argas)屬、牛蜱(Boophilus)屬、短鬚蟎(Brevipalpus)屬、苜蓿苔蟎(Bryobia praetiosa)、疥癬(Chorioptes)屬、雞刺皮蟎(Dermanyssus gallinae)、葉蟎(Eotetranychus)屬、梨葉銹癭蟎(Epitrimerus pyri)、褐葉蟎(Eutetranychus)屬、銹蟎(Eriophyes)屬、半跗線蟎(Hemit- arsonemus)屬、璃眼蜱(Hyalomma)屬、硬蜱(Ixodes)屬、黑寡婦蜘蛛(Latrodectus mactans)、榆後葉蟎(Metatetranychus)屬、小爪蟎(Oligonychus)屬、鈍緣蜱(Ornithodoros)屬、葉蟎(Panonychus)屬、柑桔銹蜱(Phyllocoptruta oleivora)、茶黃蟎(Polyphagotarsonemus latus)、癢蟎(Psoroptes)屬、扇頭蜱(Rhipicephalus)屬、根蟎(Rhizoglyphus)屬、疥蟲(Sar- coptes)屬、中東金蠍(Scorpio maurus)、狹跗線(Stenotarso- nemus)屬、跗線(Tarsonemus)屬、葉蟎(Tetranychus)屬、蕃茄癭蟎(Vasates lycopersici)。

雙殼綱，例如貽貝(Dreissena)屬。

唇足綱，例如蜈蚣(Geophilus)屬、蚰蜒(Scutigera)屬。

鞘翅目，例如菜豆象(Acanthoscelides obtectus)、褐金龜(Adoretus)屬、蘭毛臀螢葉甲(Agelastica alni)、叩頭蟲(Agriotes)屬、馬鈴薯鰓金龜(Amphimallon solstitialis)、傢具甲蟲(Anobium punctatum)、星天牛(Anoplophora)屬、棉鈴象甲(Anthonomus)屬、皮蠹(Anthrenus)屬、蔗金龜(Apo- gonia)屬、隱食甲(Atomaria)屬、節蟲(Attagenus)屬、大豆象(Bruchidius obtectus)、豆象(Bruchus)屬、龜象(Ceuthor- hynchus)屬、象甲(Cleonus mendicus)、寬胸金針蟲(Cono- derus)屬、球莖象鼻蟲(Cosmopolites)屬、草地金龜甲(Coste- lytra zealandica)、象鼻蟲(Curculio)屬、楊乾象(Cryptor- hynchus lapathi)、皮蠹(Dermestes)屬、葉甲(Diabrotica)屬、瓢蟲(Epilachna)屬、蛀莖象甲(Faustinus cubae)、裸蛛甲(Gibbium psylloides)、黑翼爪蔗金龜(Heteronychus arator)、閃光金龜子甲殼蟲(Hylamorpha elegans)、天牛(Hylotrupes bajulus)、苜蓿象鼻蟲

(Hypera postica)、小蠹蟲(Hypothenemus)屬、Lachnosterna consanguinea、科羅拉多金花蟲(Leptinotarsa decemlineata)、稻水象甲(Lissor- hoptrus oryzophilus)、象鼻蟲(Lixus)屬、粉蠹(Lyctus)屬、花粉甲蟲(Meligethes aeneus)、大栗鰓角金龜(Melolontha melolontha)、天牛(Migdolus)屬、黑天牛(Monochamus)屬、果樹象鼻蟲(Naupactus xanthographus)、黃蛛甲(Niptus hololeucus)、犀角金龜(Oryctes rhinoceros)、鋸胸粉扁蟲(Oryzaephilus surinamensis)、黑蛀象鼻蟲(Otiorrhynchus sulcatus)、小青花金龜(Oxycetonia jucunda)、辣根猿葉甲(Phaedon cochleariae)、鰓角金龜(Phyllophaga)屬、日本金龜子(Popillia japonica)、象甲(Premnotrypes)屬、油菜蘭跳甲蟲(Psylliodes chrysocephala)、標本蟲(Ptinus)屬、瓢蟲(Rhizobius ventralis)、穀蠹(Rhizopertha dominica)、米象(Sitophilus)屬、象蟲(Sphenophorus)屬、Sternechus spp.、大蚊(Symphyletes)屬、黃粉蟲(Tenebrio molitor)、擬穀盜蟲(Tribolium)屬、鰹節蟲(Trogoderma)屬、籽象(Tychius)屬、脊虎天牛(Xylotrechus)屬、距步甲(Zabrus)屬。

彈尾目，例如食微線蟲(Onychiurus armatus)。

革翅目，例如地蜈蚣(Forficula auricularia)。

倍足綱，例如斑蛇蜈蚣(Blaniulus guttulatus)。

雙翅目，例如斑紋(Aedes)屬、瘧蚊(Anopheles)屬、聖馬克蒼蠅(Bibio hortulanus)、麗蠅(Calliphora erythroce- phala)、地中海果實蠅(Ceratitis capitata)、大頭麗蠅(Chry- somyia)屬、螺旋蠅(Cochliomyia)屬、嗜人瘤蠅蛆(Cordy- lobia anthropophaga)、庫蚊(Culex)屬、馬蠅(Cuterebra)屬、橄欖蠅(Dacus oleae)、人膚蠅(Dermatobia hominis)、果蠅(Drosophila)屬、廁蠅(Fannia)屬、胃蠅(Gastrophilus)屬、黑蠅(Hylemyia)屬、西波伯斯卡(Hyppobosca)屬、牛皮蠅(Hypoderma)屬、斑潛蠅(Liriomyza)屬、綠蠅(Lucilia)屬、蒼蠅(Musca)屬、椿象(Nezara)屬、牛虻(Oestrus)屬、瑞典麥稈蠅(Oscinella frit)、扣藍葦潛葉蠅(Pegomyia hyos- cyami)、草種

蠅(Phorbia)屬、螯蠅(Stomoxys)屬、虻(Tabanus)屬、Tannia 屬、沼澤大蚊(Tipula paludosa)、污蠅(Wohlfahrtia)屬。

腹足綱，例如蛞蝓(Arion)屬、雙臍螺(Biomphalaria)屬、水泡螺(Bulinus)屬、野蛞蝓(Deroceras)屬、土蝸(Galba)屬、椎實螺(Lymnaea)屬、釘螺(Oncomelania)屬、椎實蝸牛(Succinea)屬。

蠕蟲綱，例如十二指腸鉤蟲(Ancylostoma duodenale)、錫蘭鉤蟲(Ancylostoma ceylanicum)、巴西鉤蟲(Acylostoma braziliensis)、鉤蟲(Ancylostoma)屬、魯比寇蛔蟲(Ascaris lubricoides)、迴蟲(Ascaris)屬、馬來絲蟲(Brugia malayi)、汶來絲蟲(Brugia timori)、反芻獸之鉤蟲(Bunostomum)屬、Chabertia 屬、吸蟲(Clonorchis)屬、庫柏毛樣線蟲(Cooperia)屬、吸蟲(Dicrocoelium)屬、絲狀網尾線蟲(Dictyocaulus filarial)、廣節裂頭條蟲(Diphyllobothrium latum)、麥地那線蟲(Dracunculus medinensis)、犬包囊條蟲(Echinococcus granulosus)、多房性包生條蟲(Echinococcus multilocularis)蟯蟲(Enterobius vermicularis)、牛羊肝吸蟲(Faciola)屬、血矛線蟲(Haemonchus)屬、雞刺線蟲(Heterakis)屬、短小包膜條蟲(Hymenolepis nana)、Hyostrongulus spp.、羅阿絲蟲(Loa Loa)、細頸線蟲(Nematodirus)屬、食道口線蟲(Oeso- phagostomum)屬、肝吸蟲(Opisthorchis)屬、Onchocerea volvulus、胃蟲(Ostertagia)屬、肺吸蟲(Paragonimus)屬、Schistosomen 屬、福氏類圓線蟲(Strongyloides fuelle- borni)、糞小桿線蟲(Strongyloides stercoralis)、腸道蟯蟲(Stronyloides)屬、無鉤條蟲(Taenia saginata)、有鉤條蟲(Taenia solium)、豬旋毛蟲(Trichinella spiralis)、犬旋毛蟲(Trichinella native)、布氏旋毛蟲(Trichinella britovi)、旋毛蟲(Trichinella nelsoni)、偽旋毛蟲(Trichinella pseudo- opsiralis)、Trichostrongulus 屬、鞭蟲(Trichuris trichuria)、班氏絲蟲(Wuchereria bancrofti)。

其進一步可控制原蟲，諸如艾美球蟲(Eimeria)。

異翅亞目，例如菜瓜蟲(Anasa tristis)、椿象(Antestiopsis)屬、長椿

象(Blissus)屬、俊盲椿象(Calocoris)屬、盲椿象(Campy- lomma livida)、椿象(Cavelerius)屬、臭蟲(Cimex)屬、綠椿象(Creontiades dilutus)、Dasynus piperis、椿象(Dichelops furcatus)、辣椒臭蟲(Diconocoris hewetti)、椿象(Dysdercus)屬、褐臭椿象(Euschistus)屬、扁盾椿象(Eurygaster)屬、Heliopeltis 屬、植物臭蟲(Horcias nobilellus)、緣椿象(Leptocorisa)屬、葉緣椿象(Leptoglossus phyllo- pus)、盲椿象(Lygus)屬、Macropes excavatus、盲椿象(Miridae)、綠點椿象(Nezara)屬、米椿(Oebalus)屬、椿象科(Pentomidae)、方背皮椿象(Piesma quadrata)、壁椿象(Piezodorus)屬、棉偽斑腿盲椿象(Psallus seriatus)、花邊臭蟲(Pseudacysta persea)、錐鼻蟲(Rhodnius)屬、可可褐盲創椿象(Sahlbergella singularis)、黑椿象(Scotinophora)屬、梨冠網椿象(Stephanitis nashi)、泰布萊卡(Tibraca)屬、錐椿象(Triatoma)屬。

同翅亞目，例如蚜蟲(Acyrthosipon)屬、沫蟬(Aeneolamia)屬、隆脈木蝨(Agonoscena)屬、粉蝨(Aleurodes)屬、甘蔗穴粉蝨(Aleurolobus barodensis)、毛粉蝨(Aleurothrixus)屬、小綠葉蟬(Amrasca)屬、蚜蟲(Anuraphis cardui)、介殼蟲(Aonidiella)屬、梨瘤蚜(Aphanostigma piri)、葉蚜(Aphis)屬、葡萄浮塵子(Arboridia apicalis)、小圓盾介殼蟲(Aspidiella)屬、圓盾介殼蟲(Aspidiotus)屬、阿特尼(Atanus)屬、馬鈴薯蚜(Aulacorthum solani)、粉蝨(Bemisia)屬、Brachy- caudus helichrysii、薊馬蚜(Brachycolus)屬、甘藍蚜(Brevi- coryne brassicae)、Calligypona marginata、葉蟬(Cameo- cephala fulgida)、甘蔗棉蚜蟲(Ceratovacuna lanigera)、沫蟬科(Cercopidae)，角蠟蚧(Ceroplastes)屬、草莓蚜(Chaetosiphon fragaefolii)、印尼雪盾蚧(Chionaspis tegalensis)、茶小綠葉蟬(Chlorita onukii)、核桃黑斑蚜(Chromaphis juglan- dicola)、褐圓介殼蟲(Chrysomphalus ficus)、葉蟬(Cicadu- lina mbila)、Coccomytilus halli、堅介殼蟲(Coccus)屬、蚜蟲(Cryptomyzus ribis)、黃翅葉蟬(Dalbulus)屬、粉蝨(Dia- leurodes)屬、木蝨(Diaphorina)屬、介殼蟲(Diaspis)屬、棉蚜

(Doralis)屬、草履蚧(Drosicha)屬、圓尾蚜(Dysaphis)屬、粉蚧(Dysmicoccus)屬、葉蟬(Empoasca)屬、綿蚜(Eriosoma)屬、白翅葉蟬(Erythroneura)屬、畢洛貝特葉蟬(Euscelis bilobatus)、咖啡荒粉蚧(Geococcus coffeae)、琉璃葉蟬(Homalodisca coagulate)、桃粉蚜(Hyalopterus arundinis)、吹綿介殼蟲(Icerya)屬、褐葉蟬(Idiocerus)屬、扁喙葉蟬(Idioscopus)屬、灰飛蝨(Laodelphax striatellus)、扁堅介殼蟲(Lecanium)屬、牡蠣蚧(Lepidosaphes)屬、偽菜蚜(Lipaphis erysimi)、長管蚜(Macrosiphum)屬、沫蟬(Mahanarva fim- briolata)、高粱黍蚜(Melanaphis sacchari)、Metcalfiella 屬、薔薇麥蚜(Metopolophium dirhodum)、平翅斑蚜(Monellia costalis)、黃色山核桃蚜蟲(Monelliopsis pecanis)、桃蚜(Myzus)屬、萵苣蚜蟲(Nasonovia ribisnigri)、黑尾葉蟬(Nephotettix)屬、水稻褐飛蝨(Nilaparvata lugens)、麥蠟蟬(Oncometopia)屬、旌蚧(Orthezia praelonga)、楊梅粉蝨(Parabemisia myricae)、枸杞木蝨(Paratrioza)屬、盾蚧(Par- latoria)屬、Pemphigus 屬、玉米飛蝨(Peregrinus maidis)、粉介殼蟲(Phenacoccus)屬、平翅綿蚜(Phloeomyzus pass- erinii)、指頭蚜(Phorodon humuli)、葡萄根瘤蚜(Phylloxera)屬、柑桔並盾介殼蟲(Pinnaspis aspidistrae)、粉介殼蟲(Planococcus)屬、厚綠原綿介殼蟲(Protopulvinaria pyri- formis)、桑介殼蟲(Pseudaulacaspis pentagona)、粉蚧(Pseu- dococcus)屬、梨木蝨(Psylla)屬、金小蜂(Pteromalus)屬、璐蠟蟬(Pyrilla)屬、梨圓介殼蟲(Quadraspidiotus)屬、Quesada gigas、平粉介殼蟲(Rastrococcus)屬、縊管蚜屬(Rhopalosiphum)屬、硬蚧(Saissetia)屬、Scaphoides titanus、麥二叉蚜(Schizaphis graminum)、刺圓盾介殼蟲(Selenaspidus articulatus)、飛蝨(Sogata)屬、白背飛蝨(Sogatella furcifera)、浮塵子(Sogatodes)屬、Stictocephala festina、Tenalaphara malayensis、Tinocallis caryaefoliae、纓小蜂(Tomaspis)屬、小桔蚜(Toxoptera)屬、溫室粉蝨(Trialeurodes vaporariorum)、木蝨(Trioza)屬、翻斤斗葉跳蟲(Typhlocyba)屬、盾介殼蟲(Unaspis)屬、葡萄

根瘤蚜(Viteus vitifolii)。

膜翅目，例如松葉蜂(Diprion)屬、實葉蜂(Hoplocampa)屬、毛蟻(Lasius)屬、小黃家蟻(Monomorium pharaonis)、虎頭蜂(Vespa)屬。

等足目，例如鼠婦(Armadillidium vulgare)、壁潮蟲(Oniscus asellus)、球鼠婦(Porcellio scaber)。

等翅目，例如散白蟻(Reticulitermes)屬、土白蟻(Odontotermes)屬。

鱗翅目，例如桑劍紋夜蛾(Acronicta major)、白斑煩夜蛾(Aedia leucomelas)、地老虎(Agrotis)屬、阿拉巴馬蛾(Alaba- ma argillacea)、夜蛾(Anticarsia)屬、甘藍夜蛾(Barathra brassicae)、稜巢蛾(Bucculatrix thurberiella)、松樹尺蠖(Bupalus piniarius)、黃尾卷葉蛾(Cacoecia podana)、Capua reticulana、蘋果蠹蛾(Carpocapsa pomonella)、Cheimatobia brumata、螟蟲(Chilo)屬、樅芽蛀蛾(Choristoneura fumiferana)、葡萄螟蛾(Clysia ambiguella)、Cnaphalocerus 屬、棉斑實蛾(Earias insulana)、地中海粉斑螟(Ephestia kuehniella)、褐尾蛾(Euproctis chrysorrhoea)、切夜蛾(Euxoa)屬、褐葉蛾(Feltia)屬、對大蠟螟(Galleria mellonella)、夜蛾(Helicoverpa)屬、棉鈴蟲(Heliothis)屬、Hofmannophila pseudospretella、茶長捲葉蛾(Homona magnanima)、蘋果巢蛾(Hyponomeuta padella)、甜菜夜蛾(Laphygma)屬、金紋細蛾(Lithocolletis blancardella)、Lithophane antennata、Loxagrotis albicosta、毒蛾(Lymantria)屬、黃褐天幕毛蟲(Malacosoma neustria)、甘藍夜蛾(Mamestra brassicae)、Mocis repanda、粘蟲(Mythimna separate)、Oria 屬、負泥蟲(Oulema oryzae)、冬夜蛾(Panolis flammea)、紅鈴蟲(Pectinophora gossypiella)、柑桔潛葉蛾(Phyllocnistis citrella)、白粉蝶(Pieris)屬、小菜蛾(Plutella xylostella)、斜紋盜蛾(Prodenia)屬、粟夜蛾(Pseudaletia)屬、大豆夜蛾(Pseudoplusia includens)、鑽心蟲(Pyrausta nubilalis)、斜紋夜蛾(Spodoptera)屬、Thermesia gemmatalis、衣蛾(Tinea pellionella)、衣蛾(Tineola bisselliella)、Tortrix viridana、粉夜蛾(Trichoplusia)屬。

直翅目，例如蟋蟀(Acheta domesticus)、東方蜚蠊(Blatta orientalis)、德國蜚蠊(Blattella germanica)、螻蛄(Gryllo- talpa)屬、佛羅里達蟑螂(Leucophaea maderae)、飛蝗(Locusta)屬、蝗蟲(Melanoplus)屬、美洲蜚蠊(Periplaneta Americana)、非洲沙漠蝗蟲(Schistocerca gregaria)、

蚤目，例如鼠蚤(Ceratophyllus)屬、印度鼠蚤(Xenopsylla cheopis)。

綜合綱(Symphyla)，例如么蚰(Scutigerella immaculate)。

纓翅目，例如稻薊馬(Baliothrips biformis)、Enneothrips flavens、花薊馬(Frankliniella)屬、薊馬(Heliothrips)屬、粟網薊馬(Hercinothrips femoralis)、卡薊馬(Kakothrips)屬、腹鉤薊馬(Rhipiphorothrips cruentatus)、黃薊馬(Scirto- thrips)屬、卡達摩尼薊馬(Taeniothrips cardamoni)、花薊馬(Thrips)屬。

總尾目，例如衣魚(Lepisma saccharina)。

植物寄生性線蟲，包括例如腫癭線蟲(Anguina)屬、葉芽線蟲(Aphelenchoides)屬、Belonoaimus 屬、傘真滑刃線蟲(Bursaphelenchus)屬、莖線蟲(Ditylenchus dipsaci)、包囊線蟲(Globodera)屬、Heliocotylenchus 屬、胞囊線蟲(Hetero- dera)屬、長針線蟲(Longidorus)屬、根瘤線蟲(Meloidogyne)屬、根腐線蟲(Pratylenchus)屬、荷蘭為穿孔線蟲(Rado- pholus similes)、螺旋線蟲(Rotylenchus)屬、殘根線蟲(Trichodorus)屬、矮化線蟲(Tylenchorhynchus)屬、鮀形線蟲(Tylenchulus)屬、柑桔線蟲(Tylenchulus semipene- trans)、劍線蟲(Xiphinema)屬。

若適當，根據本發明之化合物，在某些濃度或施用率下，可被用作除草劑、安全劑、生長調節劑或改良植物特性之藥劑，或作為殺微生物劑，例如殺真菌劑、抗黴菌劑、殺菌劑、殺病毒劑（包括抗類病毒之藥劑）或作為抗 MLO（黴漿菌屬-類似有機體）及 RLO（立克次體-類似有機體）之藥劑。若適當，彼等亦可被用作供合成其他活性化合物之中間體或先質。

活性化合物可被轉變成傳統之調配物，諸如溶液、乳液、可濕性

粉末、以水-及油-為底之懸浮液，粉末、粉塵、糊膏、可溶性粉末、可溶性顆粒、供散播之顆粒、懸浮液-乳液濃縮物、浸泡有活性化合物之天然物質、浸泡有活性化合物之合成物質、肥料及在聚合物物質中之微包膠。

此等調配物以已知方式製造，例如藉混合活性化合物及增量劑（其為液體溶劑及／或固體載劑），選擇性使用表面活性劑（其為乳化劑及／或分散劑及／或泡沫形成劑）。調配物係在施用之前或期間於一適當工廠或他處予以製備。

適合用作輔助劑者為適合給予組成物本身及／或衍生自其之製備物（例如噴灑液體、種子敷料）特殊特性（諸如某些技術特性及／或特殊生物特性）之物質。典型之適合的輔助劑為：增量劑、溶劑及載劑。

適當之增量劑為例如水、極性及非極性有機化學液體，例如來自芳香族及非芳香族烴類（諸如石蠟、烷基苯類、烷基萘類、氯苯類），醇類及多元醇（其若適當亦可被取代、醚化及／或酯化），酮類（諸如丙酮、環己酮）、酯類（包括脂和油）及(聚)醚類，未取代及經取代胺類、醯胺類、內醯胺（諸如 N-烷基吡咯啶酮）及內酯，碸類及亞碸類（諸如二甲基亞碸）。

若所使用之增量劑為水，則其亦可使用例如有機溶劑作為輔助溶劑。實質上，適當之液體溶劑為：芳香族化合物，諸如二甲苯、甲苯或烷基萘；氯化芳香族化合物及氯化脂族烴，諸如氯苯、氯乙烯或氯甲烷；脂族烴，諸如環己烷或石蠟，例如石油餾分，礦物油及植物油；醇類，諸如丁醇或乙二醇，以及彼等之醚類及酯類；酮類，諸如丙酮、甲乙酮、甲基異丁酮或環己酮；強極性溶劑，諸如二甲基亞碸；及水。

適當之固體載劑為：

例如銨鹽及研磨天然礦物，諸如高嶺土、黏土、滑石、石筌、石英、鎂鋁海泡石、蒙脫石或矽藻土，及研磨合成礦物，諸如微細分散

細矽石，鋁礬土及矽酸鹽；顆粒用之適當固體載劑為：例如粉碎及區分之天然岩石，諸如方解石、大理石、浮石、海泡石及白雲石，以及無機和有機穀粉之合成顆粒，及有機物質之顆粒，諸如紙、木屑、椰子殼、玉米穗軸及煙草桿；適當之乳化劑及／或泡沫形成劑為：例如非離子及陰離子表面活性劑，諸如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚，例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸鹽、烷基硫酸鹽、芳基磺酸鹽以及蛋白質水解物；適當之分散液為非離子性及／或離子性物質，例如醇-POE-及／或-POP-醚、酸及／或 POP-POE 酯，烷基芳基及／或 POP-POE 醚、脂-及／或 POP-POE 加成物、POE-及／或 POP-多元醇衍生物、POE-及／或 POP-山梨糖醇酯-或糖加成物、烷基或芳基硫酸鹽、烷基-或芳基磺酸鹽及烷基或芳基磷酸鹽或對應之 PO-醚加成物。此外，適當之低聚-或聚合物，例如那些衍生自乙烯單體、衍生自丙烯酸、衍生自單獨之 EO 及／或 PO 或與例如(聚)醇類或(聚)胺類組合者。亦可使用木質素及其之磺酸衍生物、未改質及改質之纖維素、芳香族及／或脂族磺酸及彼等與甲醛之加成物。

增黏劑，諸如粉末、顆粒或乳膠形式之羧甲基纖維素天然及合成聚合物，諸如阿拉伯膠、聚乙烯醇及聚乙烯乙酸酯，以及天然磷脂，諸如腦磷脂及卵磷脂，及合成磷脂，可被用於調配物中。

亦可使用著色劑，諸如無機顏料，例如氧化鐵、氧化鈦及普魯士藍(Prussian blue)，及有機染料，諸如茜素、偶氮染料及酞氰染料及微量營養素，諸如鐵、錳、硼、銅、鈷、鉬及鋅之鹽類。

其他可能之添加劑為香料（礦物性或植物性），選擇性改質之油、蠟及營養素（包括微量營養素），諸如鐵、錳、硼、銅、鈷、鉬及鋅之鹽類。

安定劑，諸如低溫安定劑、保存劑、抗氧化劑、光安定劑或其他改良化學及／或物理安定性之藥劑亦可存在。

調配物通常包含介於 0.01 和 98 重量%之間的活性化合物，較佳介於 0.5 和 90%之間。

根據本發明之活性化合物可被用於其之商業上可取得之調配物中，且在由此等調配物所製備之使用形式方面可為一種與其他活性化合物（諸如殺昆蟲劑、誘引劑、殺菌劑、殺細菌劑、殺蟎劑、殺線蟲劑、殺黴菌劑、生長-調節物質、殺草劑、安全劑、肥料或半化學品）之混合物形式。

特別理想的混合成分為例如下列化合物：

殺黴菌劑：

核苷酸合成之抑制劑

本達樂(benalaxyl)、本達樂-M、布瑞莫(bupirimate)、克達樂(chiralaxyl)、克利康(clozylacon)、二甲瑞克(dimethirimol)、依瑞莫(ethirimol)、扶達樂(fur- alaxyl)、希美座(hymexazol)、殺紋寧(metalaxyl)、殺紋寧-M、夫醯胺(ofurace)、歐殺斯(oxadixyl)、歐索林酸(oxolinic acid)

有絲分裂及細胞分裂之抑制劑

免賴得(benomyl)、貝芬替(carbendazim)、乙霉威(di- ethofencarb)、麥穗寧(fuberidazole)、賽克隆(pency- curon)、腐絕(thiabendazole)、甲基多保淨(thio- phanat-methyl)、草醯胺(zoxamide)

呼吸鏈複合物 I 之抑制劑

二氟林(diflumetorim)

呼吸鏈複合物 II 之抑制劑

白克列(boscalid)、萎鏽靈(carboxin)、甲呋醯胺(fen- furam)、福多靈(flutolanil)、福拉吡(furametpyr)、滅普靈(mepronil)、嘉保信(oxycarboxin)、吡噻菌胺(pen- thiopyrad)、賽氟滅(thifluzamide)

呼吸鏈複合物 III 之抑制劑

亞托敏(azoxystrobin)、賽座滅(cyazofamid)、醚菌胺(dimoxystrobin)、烯肟菌酯(enestrobin)、凡殺同(famo- xadone)、咪唑菌酮(fenamidone)、氟嘧菌酯(fluoxa- strobin)、克收欣(kresoxim-methyl)、苯氧菌胺(metom- inostrobin)、肟醚菌胺(orysastrobin)、氟環唑(pyra- clostrobin)、唑菌胺酯(picoxystrobin)、三氟敏(triflo- xystrobin)

去偶合劑

白粉克(dinocap)、扶吉胺(fluazinam)

ATP 製造之抑制劑

三苯醋錫(Fentin acetate)、三苯基氯化錫(fentin chloride)、三苯基氫氧化錫(fentin hydroxide)、矽噻菌胺(silthiofam)

胺基酸生物合成及蛋質生物合成之抑制劑

苯胺基嘧啶(andoprim)、保米黴素(blasticidin-S)、賽普洛(cyprodinil)、嘉賜黴素(kasugamycin)、嘉賜黴素氯化氫水合物、滅哌啉(mepanipyrim)、嘧霉胺(pyri- methanil)

信息傳遞之抑制劑

護汰寧(fenpiclonil)、咯菌腈(fludioxonil)、快諾芬(quinoxyfen)

脂肪及膜合成之抑制劑

克氯得(chlozolinate)、依普同(iprodione)、撲滅寧(pro- cymidone)、免克寧(vinclozolin)、安吡福(ampropylfos)、鉀-安吡福、護粒松(edifenphos)、丙基喜樂松(iprobenfos)(IBP)、亞賜圃(iso- prothiolane)、白粉松(pyrazophos)、甲基立枯磷(tolclofos-methyl)、二苯基丙環唑(biphenyl iodocarb)、普拔克(propamocarb)、普拔克氯化氫

麥角固醇生物合成之抑制劑

環烯菌胺(fenhexamid)、氧環唑(azaconazole)、比多農(bitertanol)、溴克座(bro-muconazole)、環克座(cyproconazole)、苄氯三唑醇(diclobutrazole)、惡醚唑(difenoconazole)、速保利(dini- conazole)、速保利-M，氟環唑(epoxiconazole)、乙環唑(etaconazole)、芬克座(fenbuconazole)、氟唑(fluqui- nconazole)、護矽得(flusilazole)、護汰芬(flutriafol)、護康唑(furconazole)、護康唑-順式、菲克利(hexaconazole)、易胺座(imibenconazole)、種菌唑(ipcon- azole)、滅特座(metconazole)、邁客尼(myclobutanil)、巴克素(paclobutrazole)、平克座(penconazole)、普克利(propiconazole)、普硫康唑(prothioconazole)、矽氟唑(simeconazole)、得克利(tebuconazole)、四克利(tetra- conazole)、三泰芬(triadimefon)、三泰隆(triadimenol)、滅菌唑(triticonazole)、單克素(uniconazole)、伏立康唑(voriconazole)、依滅列(imazalil)、依滅列硫酸鹽、惡咪唑(oxpoconazole)、芬瑞莫(fenarimol)、嘧醇(flur- primidol)、尼瑞莫(nuarimol)、比芬諾(pyrifenox)、賽福寧(triforine)、披扶座(pefurazoate)、撲克拉(pro- chloraz)、賽福座(triflumizole)、維尼座(vinicon- azole)、阿地隆(aldimorph)、敵草隆(dodemorph)、敵草隆乙酸鹽、芬普福(fenpropimorph)、三得芬(tridemorph)、苯鏽啶(fenpropidin)、活螺環菌胺(spiroxamine)、敵癬(naftifine)、稗草丹(pyributicarb)、特賓那芬(terbi- nafine)

細胞壁合成之抑制劑

苯噻菌唑(benthiavalicarb)、畢拉草(bialaphos)、達滅芬(dimethomorph)、氟嗎啉(flumorph)、丙森鋅(ipro- valicarb)、保粒黴素甲(polyoxins)、保粒黴素丁(poly- oxorim)、維利黴素 A(validamycin A)

黑色素生物合成之抑制劑

亞賜圃(carpropamid)、雙氯氰菌胺(diclocymet)、禾草靈(fenoxanil)、熱必斯(phthalide)、百快隆(pyroquilon)、 三賽唑(tricyclazole)

抵抗性誘發劑

苯並噻二唑(acibenzolar-S-methyl)、撲殺熱(proben- azole)、噻醯菌胺(tiadinil)

多位點(Multisite)

四氯丹(captafol)、蓋普丹(captan)、四氯異苯腈(chloro- thalonil)、銅鹽（諸如：氫氧化銅、萘酸銅、氧氯化銅、硫酸銅、氧化銅、快得寧(oxine-copper)及波爾多混合物(Bordeaux mixture)）、益發靈(dichlofluanid)、腈硫醌(dithianon)、多果定(dodine)、多果定游離鹼、福美鐵(ferbam)、滅菌丹(folpet)、夫咯皮(fluoro- folpet)、克熱淨(guazatine)、克熱淨乙酸鹽、雙胍辛胺(iminoctadine)、克熱淨烷苯磺酸鹽、雙胍辛胺三乙酸鹽、錳銅乃浦(mancopper)、鋅錳乃浦(Mancozeb)、錳乃浦(maneb)、免得爛(metiram)、免得爛鋅、甲基鋅乃浦(propineb)、硫及包含多硫化鈣之硫製備物、得恩地(thiram)、甲基益發靈(tolylfluanid)、鋅乃浦(zineb)、益穗(ziram)

未知機制

阿溴多(amibromdol)、苯噻唑(benthiazol)、苯噻咔(bethoxazin)、凱西黴素(capsimycin)、香芹酮(car- vone)、離丹(chinomethionat)、氯化苦(chloropicrin)、銅合浦(cufraneb)、環氟菌胺(cyflufenamid)、克絕(cym- oxanil)、邁隆(dazomet)、咪菌威(debacarb)、達滅淨

(diclomezine)、雙氯酚(dichlorophen)、大克爛(diclo- ran)、苯敵快(difenzoquat)、苯敵快甲基硫酸酯、二苯胺、噻唑菌胺(ethaboxam)、富米熱(ferimzone)、富麥脫(flumetover)、夫硫醯胺(flusulphamide)、氟啶醯菌胺(fluopicolide)、唑草(fluoroimide)、六氯苯、 8-羥基-喹啉硫酸鹽、人間黴素(irumamycin)、甲硫克(methasulphocarb)、苯菌酮(metrafenone)、異硫氰酸甲酯、米多黴素(mildiomycin)、鏈黴菌素(natamycin)、二甲基二硫胺基甲酸鎳、異丙消(nitrothal-isopropyl)、辛噻酮(octhilinone)、氧莫卡(oxamocarb)、氧芬辛(oxyfenthiin)、五氯酚及鹽、2-苯基酚及鹽、粉病靈(piperalin)、帕洛辛-鈉(propanosine-sodium)、丙氧喹啉(proquinazid)、吡咯亞硝酸試劑(pyrrol nitrin)、五氯硝基苯(quintozene)、克枯爛(tecloftalam)、四氯硝基苯(tecnazene)、三挫磷(triazoxide)、水楊菌胺(trichlamide)、氰菌胺(zarilamid)及 2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺醯基)吡啶、N-(4-氯-2-硝基苯基)-乙基-4-甲基苯磺醯胺、2-胺基-4-甲基-N-苯基-5-噻唑甲醯胺、2-氯-N- (2,3-二氫-l,l,3-三甲基-1H-茚-4-基)-3-吡啶-甲醯胺、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基異噁唑啶-3-基]吡啶、順式-1-(4-氯-苯基)-2-(1H-l,2,4-三唑-1-基)環庚醇、2,4-二氫-5-甲氧基-2-甲基-4-[[[[l-[3-(三氟甲基)苯基]亞乙基]胺基]氧基]甲基]苯基]-3H-l,2,3-三唑-3-酮(185336- 79-2)、甲基 1-(2,3-二氫-2,2-二甲基-1H-茚-1-基)-1H-咪唑-5-羧酸鹽、3,4,5-三氯-2,6-吡啶二腈、甲基 2-[[[環丙基[(4-甲氧基-苯基)亞胺基]甲基]硫基]甲基]-α-(甲氧基亞甲基)苯乙酸酯、4-氯-α-丙炔基氧基-N-[2[3-甲氧基-4-(2-丙炔基氧基)苯基]乙基]苯乙醯胺、(2S)-N- [2[4-[[3-(4 氯苯基)-2-丙炔基]氧基-3-甲氧苯基]乙基]- 3-甲基-2-[(甲基磺醯基)胺基]丁醯胺、5-氯-7-(4-甲基哌啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)[l,2,4]-三唑[1,5-a]嘧啶、5-氯-6(2,4,6-三氟苯基)-N-[(1R)-l,2,2-三甲基丙基]-[l,2,4]三唑基[1,5-a]嘧啶-7-胺、5-氯-N- [(1R)-1,2-二甲基丙基]-6-(2,4,6-三氟苯基)[l,2,4]

三唑基[1,5-a]嘧啶-7-胺、N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯菸鹼醯胺、N-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)甲基]-2,4-二氯菸鹼醯胺、2-丁氧基-6-碘-3-丙基苯并哌喃-4-酮、N-{(Z)- [(環丙基甲氧基)亞胺基][6-二氟甲氧基]-2,3-二氟苯基}甲基}2-苯乙醯胺、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、2[[[[1-[3(1-氟-2-苯基-乙基)氧基]苯基]亞乙基]胺基]氧基]甲基]-α-(甲氧基亞胺基)-N-甲基-α-苯乙醯胺、N-{2-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]乙基}-2-(三氟甲基)苯甲醯胺、N-(3',4'-二氯-5-氟聯苯-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡咯-4-甲醯胺、N-(6-甲氧基-3-吡啶基)環丙烷甲醯胺、1-[(4-甲氧基苯氧基)甲基]-2,2-二甲基丙基-1H-咪唑-1-羧酸、O-[1-[(4-甲氧基苯氧基)甲基]-2,2-二甲基丙基-1H-咪唑-1-硫甲酸、2-(2{[6-(3-氯-2-甲基苯氧基)-5-氟嘧啶-4-基]氧基}苯基)-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基-乙醯胺

殺菌劑

溴硝醇(bronopol)、雙氯酚、三氯甲基啶(nitrapyrin)、二甲基二硫胺基甲酸鎳、嘉賜黴素、辛噻酮、呋喃羧酸、羥四環素、撲殺熱、鏈黴素、克枯爛、硫酸銅及其他銅製備物

殺昆蟲劑／殺恙蟲劑／殺線蟲劑

乙醯膽鹼酯(AChE)抑制劑

胺基甲酸酯類，

例如棉鈴威(alanycarb)、得滅克(aldicarb)、涕滅威(aldoxycarb)、除害威(allyxycarb)、安美加(aminocarb)、免敵克(bendiocarb)、免扶克(benfuracarb)、必克蝨(bu- fencarb)、畜蟲威(butacarb)、佈嘉信(butocarboxim)、丁酮威(butoxycarboxim)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、加保磺(carbosulphan)、除線威(clo- ethocarb)、敵蠅威(dimetilan)、愛芬克(ethiofencarb)、丁基滅必蝨(fenobucarb)、苯硫威(fenthiocarb)、覆滅(formetanate)、氟硫克(furathiocarb)、滅

必蝨(isopro- carb)、二硫代氨基甲酸鈉(metam-sodium)、滅賜克(methiocarb)、納乃得(methomyl)、治滅蝨(metolcarb)、歐殺滅(oxamyl)、比加普(pirimicarb)、普滅克(pro- mecarb)、安丹(propoxur)、硫敵克(thiodicarb)、硫芬司(thiofanox)、混滅威(trimethacarb)、XMC、來利卡(xylylcarb)、三唑麥(triazamate)

有機磷酸酯類，

陶歐松(acephate)、亞滅松(azamethiphos)、谷速松(azi- nphos)(-甲基，-乙基)、溴磷松(bromophos)-乙基、溴芬松(bromfenvinfos)(-甲基) 佈殺松(butathiofos) 硫線磷(cadusafos)、加芬丁滅蝨(carbophenothion)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、氯芬松(chlorfenvinphos)、氯甲硫磷(chlormephos)、陶斯松(chlorpyrifos)(-甲基／-乙基)、蠅毒磷(coumaphos)、施力松(cyanofenphos)、氰乃松(cyanophos)、氯芬松(chlorfenvinphos)、滅賜松(dimeton-S-methyl)、滅賜颯松(dimeton-S-methyl sulphon)、得拉松(dialifos)、大利松(diazinon)、二氯芬松(dichlofenthion)、二氯松(dichlorvos)／DDVP、雙特松(dicrotophos)、大滅松(dimethoate)、甲基美文松(dimethylvinphos)、蔬果磷(dioxabenzofos)、二硫松(disulphoton)、EPN、愛殺松(ethion)、普滅蝨(ethoprophos)、益多松(etrimfos)、氨磺磷(famphur)、芬滅松(fenamiphos)、撲滅松(fenitrothion)、繁福松(fensulfothion) 芬殺松(fenthion)、吡氟硫磷(flupyr- azofos)、大福松(fonofos)、福木松(formothion)、丁苯硫磷(fosmethilan)、福賽絕(fosthiazate)、飛達松(heptenophos)、碘芬福(iodofenphos)、丙基喜樂松(iprobenfos)、依殺松(isazofos)、亞芬松(isofen- phos)、異丙基 O-水楊酸酯、加福松(isoxathion)、馬拉松(malathion)、滅加松(mecarbam)、滅克松(meth- acrifos)、達馬松(methamidophos)、滅大松(methida- thion)、美文松(mevinphos)、亞素靈(monocrotophos)、乃力松(naled)、歐滅松(omethoate) 滅多松

(oxyde- meton-methyl)、巴拉松(parathion) (-甲基／-乙基)、賽達松(phenthoate)、福瑞松(phorate)、裕必松(phosa- lone)、益滅松(phosmet)、福賜米松(phosphamidon)、磷福克(phosphocarb)、巴賽松(phoxim)、亞特松(pirimiphos) (-甲基／-乙基)、佈飛松(profenofos)、加護松(propaphos)、胺丙畏(propetamphos)、普硫松(pro- thiofos)、飛克松(prothoate)、白克松(pyraclofos)、必芬松(pyridaphenthion)、比達松(pyridathion)、拜裕松(quinalphos)、克線丹(sebufos) 治螟磷(sulfotep)、甲丙硫磷(sulprofos)、特匹松(tebupirimfos)、亞培松(tem- ephos)、托福松(terbufos)、樂本松(tetrachlorvinphos)、 硫滅松(thiometon)、三落松(triazophos)、三氯松(trichlorfon)、繁米松(vamidothion)

鈉通道調節劑／電壓-依賴性鈉通道阻斷劑

DDT

噁二咔類(oxadiazines)，

例如因得克(indoxacarb)

半卡巴腙類，

例如巴斯夫(metaflumizone)(BAS3201)

乙醯膽鹼受體促動劑／拮抗劑

氯菸鹼類，

例如亞滅培(acetamiprid)、可尼丁(clothianidin)、達特南(dinotefuran)、益達胺(imidacloprid)、尼蟲胺(niten- pyram)、尼賽胼(nithiazine)、賽克(thiacloprid)、氯噻啉(imidaclothiz)、AKD-1022、賽速安(thiamethoxam)

尼古丁(nicotine)、免速達(bensultap)、培丹(cartap)

乙醯膽鹼受體調節劑

賜諾殺類(Spinosyns)，

例如賜諾殺(spinosad)、賜諾特雷(spinetotam)(XDE- 175)

GABA-控制之氯離子通道拮抗劑

有機氯類，

例如毒殺芬(camphechlor)、可氯丹(chlordane)、安殺番(endosulphan)、γ-HCH, HCH、庚特氯(heptachlor)、蕉特寧(lindane)、甲氧氯(methoxychlor)

非普類(fiprols)

例如歐殺松(acetoprole)、愛地白(ethiprole)、芬普尼(fipronil)、比福普(pyrafluprole)、比瑞普(pyriprole)、馬力普(vaniliprole)

氯離子通道活化劑

麥汀類(mectins)

例如阿巴汀(avermectin)、乙麥汀(emamecthin)、乙麥汀-苯甲酸酯、百蟲滅(ivermectin)、勒皮麥丁(lepi- mectin)、米貝黴素(milbemycin)

保幼激素擬似物

例如達芬隆(diofenolan)、依普芬隆(epofenonane)、芬諾克(fenoxycarb)、氫吡(hydroprene)、烯蟲炔酯(kino- prene)、美賜平(methoprene)、百利普芬(pyriproxy- fen)、三普林(triprene)

脫皮酮促動劑／破壞劑

二醯肼類

例如硫環殺(chromafenozide)、合芬氮(halofenozide) 甲氧芬諾(methoxyfenozide)、得芬諾(tebufenozide)

幾丁質生合成抑制劑

苯甲醯脲類，

例如雙三氟蟲脲(bistrifluron)、克福隆(chlorfluaz- uron)、二福隆(diflubenzuron)、福隆(fluazuron)、氟環脲(flucycloxuron)、氟芬隆(flufenoxuron)、六伏隆(hexaflumuron)、祿芬隆(lufenuron)、雙苯氟

脲(novaluron)、諾氟隆(noviflumuron)、賽伏隆(pen- fluron)、得福隆(teflubenzuron)、三福隆(triflumuron)

布芬淨(buprofezin)

賽滅淨(cyromazine)

氧化性磷酸化抑制劑，ATP 破壞劑

汰芬隆(diafenthiuron)

有機錫化合物，

例如亞環錫(azocyclotin)、錫滿丹(cyhexatin)、芬布賜(fenbutatin-oxide)

藉干擾 H-質子梯度之氧化性磷酸化去偶合作用

吡咯類，

例如克凡哌(chlorfenapyr)

二硝基酚類，

例如百克(binapacryl)、大脫滿(dinobuton)、白粉克(dinocap)、DNOC

位址-I 電子傳遞抑制劑

METIs 類

例如芬殺滿(fenazaquin)、芬普噻(fenpyroximate)、畢汰芬(pyrimidifen)、畢達本(pyridaben)、吡蟎胺(tebu- fenpyrad)、特芬雷(tolfenpyrad)

氫甲隆(hydramethylnone)

大克莽(dicofol)

位址-II 電子傳遞抑制劑

魚藤酮

位址-III 電子傳遞抑制劑

亞喹諾(acequinocyl)、福克吡(fluacrypyrim)

昆蟲腸管膜之微生物破壞劑

蘇力菌菌株

脂肪合成抑制劑

季酮酸類(tetronic acid)，

例如螺克芬酯(spirodiclofen)、螺米芬(spiromesifen)、

特米酸類(Tetramic acids)，

例如螺特酸鹽(spirotetramate)

甲醯胺類，

例如福隆克米(flonicamid)

章魚胺生成促動劑類

例如三亞螨 (amitraz)

鎂-刺激性 ATPase 之抑制劑，

歐哌多(propargite)

沙蠶毒素(nereistoxin)類似物，

例如硫賜安(thiocyclam hydrogen oxalate)、硫坦鈉(thiosultap-sodium)

理阿諾鹼(ryanodine)受體拮抗劑

苯甲酸二甲醯胺

例如氟蟲醯胺(flubendiamid)

氨茴醯胺類，

例如雷尼吡(rynaxypyr) (3-溴-N-{4-氯-2-甲基-6-[{(甲基胺基)羰基}苯基]-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-甲醯胺}

生物性荷爾蒙或費洛蒙

印楝素(azadirachtin)、枯草桿菌屬、白僵菌屬、可得蒙(codlemone)、綠殭菌屬、擬青黴屬、蘇力菌素、輪枝孢菌屬

具未知或非特定作用機制之活性化合物

煙薰劑，

例如磷化鋁、甲基溴、氟化硫

拒食劑，

例如克里來(cryolite)、福隆克米(flonicamid)、哌滅淨(pymetrozine)

蟎生長抑制劑，

例如布賜芬(clofentezine)、依殺唑(etoxazole)、合賽多(hexythiazox)醯胺伏美(amidoflumet)、拜克賜(benclothiaz)、苄西脫(benzoximate)、聯苯肼酯(bifenazate)、新殺(bromo- propylate)、布芬淨(buprofezin)、蟎離丹(chinome- thionat)、克死蟎(chlordimeform)、克氯苯(chloro- benzilate)、氯化苦(chloropicrin)、環賽平(clothi- azoben)、環平(cycloprene)、西氟米特芬(cyflumeto-fen)、二環尼(dicyclanil)、芬克米(fenoxacrim)、芬汰尼(fentrifanil)、福苯米(flubenzimine)、護賽寧(flufen- erim)、氟坦寧(flutenzin)、誘蟲十六酯(gossyplure)、氫甲隆(hydramethylnone)、日本祿(japonilure)、惡蟲酮(metoxadiazone)、石油、向日葵基丁氧化物、油酸鉀、比達利(pyridalyl)、氟蟲胺(sulfluramid)、得脫滿(tetradifon)、得脫速(tetrasul)、苯瑞噻(triarathene)、馬佈汀(verbutin)。

一種與其他已知活性化合物，諸如殺草劑、肥料、生長調節劑、安全劑、半化學品或其他藥劑之混合物用以改善植物特性亦為可行的。

根據本發明之活性化合物當被用作殺昆蟲劑時可另以彼等商業上可取得之調配物及以由此等調配物所製備之使用形式，以一種含協乘劑之混合物存在。協乘劑為增加活性化合物作用之化合物，所添加之協乘劑本身無須具活性。

根據本發明之活性化合物當被用作殺昆蟲劑時可另以彼等商業上可取得之調配物及以由此等調配物所製備之使用形式，以一種含抑制劑之混合物存在，抑制劑在被用於植物環境、於植物之部分之表面或

於植物組織之後可降低活性化合物之分解。

由商業上可取得之調配物所製備之使用形式之活性化合物之含量可在廣範圍內變動。使用形式之活性化合物濃度以活性化合物之重量計為 0.00000001 至 95%，較佳介於 0.00001 和 1 重量%之間。

化合物以適合使用形式之傳統方式來使用。

所有之植物及植物部分可根據本發明予以處理。應瞭解植物在本文中意指所有之植物及植物族群，諸如期望及非所欲之野生植物或作物植物（包括天然產生之作物植物）。作物植物可為藉傳統植物種植及最適化方法或藉生物技術及基因工程方法或此等方法之組合予以獲得之植物，包括基因轉殖植物及包括能或不能藉植物育種者權所保護之植物栽培品種。應瞭解植物局部意指所有植物之地上及地下部分及器官，諸如苗芽、葉、花及根，一可提及之實例為樹葉、針葉、莖、樹幹、花、果實體、果實、種子、根、塊莖及根莖。植物局部亦包括收穫後之材料及無性及有性繁殖材料，例如幼苗、塊莖、塊根、切片及種子。

根據本發明之植物及植物局部藉活性化合物組合物之處理可根據傳統處理方法，例如藉浸泡、噴霧、噴射、蒸發、霧化、散播、塗刷施用，直接實施或藉使化合物作用於環境、生長地或貯存區域來進行，且在繁殖材料之情況下（特別是種子），亦須單一或多重塗覆。

根據本發明之混合物特別適合處理種子。此處，上述為較佳或特佳之根據本發明之組合物可被提及為較佳者。因此，大部分因有害生物所引起之對作物植物之傷害係早自當貯存期間種子受侵襲時或在種子被種植於土壤中之後，在植物發芽期間或之後立即發生。由於生長中之植物之根及鞘特別敏感，即使極小的損傷都可能導致整株植物的死亡，所以此階段特別重要。因此藉使用適當之組成物保護種子及發芽植物特別重要。

藉處理植物種子以控制有害生物早已為人所熟知，且為連續改良之主題。然而，種子之處理面臨通常不能以令人滿意方式解決之一系列問題。因此，理想的是發展保護種子及發芽植物之方法，其在播種之後或在植物冒出頭之後可省卻額外施用作物保護劑。進一步理想的是，使依此方式所使用之活性化合物之用量最適化，以提供種子及發芽植物最大保護免於有害生物之侵襲，而不會被所使用之活性化合物傷害植物本身。尤其，種子之處理方法亦考慮轉殖基因的內在殺昆蟲特性，以在最小使用量之作物保護劑下達成種子及發芽植物最適保護。

本發明之一項優點在於，根據本發明之組成物之特殊系統特性意表種子以此等組成物之處理不僅保護種子本身，亦保護發芽後形成之植物免受有害生物侵襲。依此方式，可省卻在播種時或之後極短時間內立即處理作物。

另一優點為相較於殺昆蟲性之個別活化合物，協乘性增加之根據本發明之組成物之殺昆蟲活性，其超過兩活性化合物當個別施用時所預期之活性。亦有利的是相較於殺黴菌之個別活化合物，協乘性增加之根據本發明之組成物之殺黴菌活性，其超過兩活性化合物當個別施用時所預期之活性。這使得所使用之活性化合物之用量可被最佳化。

此外，必須視為是有利的是，根據本發明之混合物亦可特別被用於基因轉殖種子，由此等種子所形成之植物可表現抵抗有害生物之蛋白質。藉以根據本發明之組成物處理此等種子，某些有害生物可僅藉例如殺昆蟲蛋白質的表現予以控制，且亦藉根據本發明之組成物予以保護免受損害。

根據本發明之組成物適合保護任何上述被用於農業、森林或園藝中之植物品種的種子。尤其，此例如為玉米、花生、菜籽、芸苔、罌粟、大豆、棉花、糖蘿蔔（例如甜菜及飼用甜菜菜）、米、高粱及小米、小麥、大麥、燕麥、黑麥、葵花、煙草、馬鈴薯或蔬菜（例如蕃茄、

甘藍植物）之種子。根據本發明之組成物同樣適合用於處理已於前述之水果植物及蔬菜之種子形式。玉米、大豆、棉花、小麥及菜籽或芸苔之種子的處理特別重要。

如前所述，以根據本發明之組成物處理基因轉殖種子亦為特別重要的。此例如為植物種子形式，其通常包含至少一種控制具特別殺昆蟲特性之多肽表現之異質基因。於本文中，在基因轉殖種子中之異質基因，可衍生自微生物，諸如枯草桿菌、根瘤細菌屬、假單胞菌屬、鋸桿菌屬、木黴屬、棒形桿菌屬、菌根菌屬或膠狀腈黴菌屬。本發明特別適合處理包含至少一種源自枯草桿菌屬之異質基因且其之基因產物顯示抵抗歐洲玉米螟蟲及／或玉米根蟲活性之基因轉殖種子。特佳為衍生自蘇力菌之異質基因。

於本發明之內容中，根據本發明之組成物單獨或於一適當調配物中被施用至種子。較佳地，種子係在足以在處理期間避免傷害之狀態中被處理。通常，種子可在收穫及播種之間的任何時點予以處理。一般所使用之種子已與植物分離且無玉米穗軸、殼、桿、種皮、毛髮或果實之果肉。

當處理種子時，通常必須注意的是，施至種子之根據本發明之組成物之用量及／或其他添加之用量係選擇使種子之發芽不受有害之影響或者形成之植物不受損害者。此在於某些施用率下具有植物毒性效果之活性化合物之情況中特別需牢記在心。

已如上所述，所有之植物及彼等之部分可根據本發明予以處理。於一較佳具體例中，係處理野生植物物種及植物品種，或那些藉傳統生物育種方法（諸如雜交或原生質體融合）所獲得者及其之部分。於另一較佳具體例中，乃處理已藉基因工程方法，若適當組合傳統方法所獲得之基因轉殖植物及植物品種（基因改質之有機體）及其之部分。術語“部分”或“植物部分”或“植物部分”已說明如上述。

特佳地，分別可自商場取得或於使用中之植物品種之植物可根據本發明予以處理。應瞭解植物品種意表已藉傳統種植、藉突變或藉重組 DNA 技術所種植之具有新穎特性("特徵")之植物。彼等可為變體、生物型及基因型。

視植物物種或植物品種、彼等之地域及生長環境（土壤、氣候、生長期、營養）而定，根據本發明之處理亦可造成超加成（協乘性）效果。因此，例如，降低施用率及／或作用範圍之擴展及／或增加根據本發明所使用之物質及組成物之效果、更好的植物生長、增加之對高或低溫之耐受性、增加之對乾旱或水含量或土壤鹽含量之耐受性、增加之開花行為、較容易的收穫、加速之成熟、較高的收成率、收穫產物之較高的品質及／或較高的營養價值、收穫產物之較佳的貯存穩定性及／或加工性均可能超過實質所預期之效果。

較佳供根據本發明處理之基因轉殖植物或植物品種（亦即藉基因工程所獲得）包括所有藉由基因技術改良，接受賦予此等植物特殊有利及有價值特性之基因材料之植物。此等特性之實例為較優良之植物生長、增加之對高或低溫之耐受性、增加之對乾旱或水或土壤鹽含量之耐受性、增加之開花行為、較容易的收穫、加速的成熟度、較高的收成率、收穫產物之較高品質及／或較高之營養價值、收穫產物之較佳貯存穩定性及／或加工性。此等特性之進一步及特別強調之實例為植物抵抗動物及微生物有害物（諸如抵抗昆蟲、蠕、植物致病性黴菌、細菌及／或病毒）之強化防禦力，以及增加植物對特殊活性除草物質之耐受性。可提及之基因轉殖植物之實例為重要作物植物，諸如穀類（小麥、稻米）、玉米、大豆、馬鈴薯、甜菜、蕃茄、碗豆及其他蔬菜品種、棉花、煙草、油菜籽及水果植物（水果類如蘋果、梨、柑橘水果及葡萄），特別強調者為玉米、大豆、馬鈴薯、棉花、煙草及油菜籽。特別強調之特性為植物藉由在植物體內所形成毒素（特別是那些藉來

自蘇力菌(Bacillus thuringiensis)之基因材料，例如藉基因 CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c Cry2Ab、Cry3Bb 及 CryIF 及彼等之組合而在植物體（以下稱"Bt 植物"）內所產生者）抵抗昆蟲、蛛形綱動物、線蟲類及蛞蝓及蝸牛）之強化防禦力。特別強調之特性為增加由系統誘導抗病性(SAR)、系統性蛋白質(systemin)、植物抗菌素、誘發因子及抵抗基因，以及據此表現之蛋白質及毒素所致之植物抵抗黴菌、細菌及病毒之防禦力。其他特別強調之特性為植物對某些活性除草物質（例如咪唑啉酮、磺醯脲、嘉磷塞或固殺草(phosphinotricin)(例如"PAT"基因)）增加的耐受性。賦與討論中之期望特性之基因於基因轉殖植物中亦可互相組合存在。可提及之"Bt 植物"之實例為玉米品種、棉花品種、大豆品種及馬鈴薯品種，彼等被販賣之商品名為 YIELD GARD®（例如玉米、棉花、大豆）、KnockOut®（例如玉米）、StarLink®（例如玉米）、Bollgard®（例如棉花）、Nucotn®（棉花）及 NewLeaf®（馬鈴薯）。可提及之除草劑-耐受性植物之實例為玉米品種、棉花品種及大豆品種，彼等被販賣之商品名為 Roundup Ready®（耐受嘉磷塞，例如玉米、棉花、大豆）、Liberty Link®（耐受固殺草，例如油菜籽）、IMI®（耐受咪唑啉酮）及 STS®（耐受磺醯脲，例如玉米）。可提及之抗除草劑植物（為除草劑耐受性而以傳統方式種植之植物）之實例包括以商品名 Clearfield®所販售之品種（例如玉米）。當然，此等論述亦適用於具有此等基因特性或未來所開發之基因特性之植物品種，而該植物品種將於未來被開發及／或販售。

所述之植物可根據本發明以一種特別有利的方式，即藉根據本發明之通式 I 之化合物及／或活性化合物之混合物予以處理。活性化合物或混合物之上述較佳範圍亦適用於此等植物之處理。特別強調者為藉於本文中特別述及之化合物或混合物處理植物。

根據本發明之活性化合物不僅可抵抗植物、衛生及貯存產物之有

害生物，亦可用於獸醫藥品領域抵抗動物寄生蟲（皮外-及體內寄生蟲），諸如硬蜱、軟蜱、獸疥、葉螨、蒼蠅（咬及舔）、寄生蒼蠅幼蟲、頭蝨、羽蝨及跳蚤。此等寄生蟲包括：

蝨目，例如血蝨(Haematopinus)屬、毛蝨(Linognathus)屬、蝨(Pediculus)屬、陰蝨(Phtirus)屬、管蝨(Solenopotes)屬。

食毛目及鈍角亞目及絲角亞目，例如毛羽蝨(Trimenopon)屬、雞羽蝨(Menopon)屬、鵝羽蝨(Trinoton)屬、牛毛蝨(Bovicola)屬、Werneckiella屬、Lepikentron 屬、食蟲虻(Damalina)屬、齧毛虱(Trichodectes)屬、Felicola 屬。

雙翅目及長角亞目(Nematocerina)和短角亞目(Brachycerina)，例如斑紋(Aedes)屬、瘧蚊(Anopheles)屬、庫蚊(Culex)屬、蚋(Simulium)屬、真蚋亞屬(Eusimulium)、白蛉(Phlebotomus)屬、沙蠅(Lutzomyia)屬、庫蠓(Culicoides)屬、斑虻(Chrysops)屬、瘤虻(Hybomitra)屬、黃虻(Atylotus)屬、虻(Tabanus)屬、麻虻(Haematopota)屬、Philipomyia 屬、蜜蜂蝨(Braula)屬、蒼蠅(Musca)屬、齒股蠅(Hydrotaea)屬、螫蠅(Stomoxys)屬、角蠅(Haematobia)屬、莫蠅(Morellia)屬、廁蠅(Fannia)屬、舌蠅(Glossina)屬、麗蠅(Calliphora)屬、綠蠅(Lucilia)屬、大頭麗蠅(Chrysomyia)屬、污蠅(Wohl- fahrtia)屬、肉蠅(Sarcophaga)屬、牛虻(Oestrus)屬、牛皮蠅(Hypoderma)屬、胃蠅屬(Gasterophilus)屬、犬蝨蠅(Hippo- bosca)屬、梅鹿蝨蠅(Lipoptena)屬、蜱蠅(Melophagus)屬。

蚤目，例如蚤(Pulex)屬、頭梳蚤(Ctenocephalides)屬、客蚤(Xenopsylla)屬、鼠蚤(Ceratophyllus)屬。

異翅亞目(Heteropterida)，例如臭蟲(Cimex)屬、錐鼻蟲(Triatoma)屬、食蟲椿象(Rhodnius)屬、大錐椿象(Pans- trongylus)屬。

蜚蠊目，例如東方蜚蠊(Blatta orientalis)、美洲蜚蠊(Periplaneta americana)、德國蜚蠊(Blattella germanica)帶蠊(Supella)屬。

蜱亞綱(Acarina)及後-及中-氣門亞目(Meta- and Mesostigmata)，例如銳緣蜱(Argas)屬、鈍緣緣蜱(Ornitho- dorus)屬、耳疥癬蟲 (Otobius)屬、硬蜱(Ixodes)屬、花蜱(Amblyomma)屬、牛蜱(Boophilus)屬、革蜱(Dermacentor)屬、血蜱(Haemophysalis)屬、璃眼蜱(Hyalomma)屬、扇頭蜱(Rhipicephalus)屬、皮刺螨(Dermanyssus)屬、Raillietia 屬、肺刺螨(Pneumonyssus)屬、氣囊螨蟲(Sternostoma)屬、蜂蟎(Varroa)屬。

輻螨亞目(前氣門亞目)及粉螨亞目(無氣門亞目)，例如蜂跗線螨(Acarapis)屬、恙蟲(Cheyletiella)屬、Ornitho- cheyletia 屬、毛蟎(Myobia)屬、Psorergates 屬、毛囊蟲(Demodex)屬、羌螨(Trombicula)屬、凸聲螨(Listrophorus)、粉螨(Acarus)屬、食酪螨(Tyrophagus)屬、嗜木螨(Calo-glyphus)屬、Hypodectes 屬、羽蜱(Pterolichus)屬、癢螨(Pso- roptes)屬、疥癬(Chorioptes)屬、疥癬蟲(Otodectes)屬、疥蟲(Sarcoptes)屬、疥癬蟲(Notoedres)屬、膝螨(Knemi- docoptes)屬、鞘螨(Cytodites)屬、皮膜螨(Laminosioptes)屬。

根據本發明之式 I 活性化合物亦適合用於控制寄生於農業生產性家畜（例如牛、羊、山羊、馬、豬、驢、駱駝、水牛、兔子、雞、火雞、鴨、鵝及蜜蜂）、其他寵物（諸如狗、貓、籠鳥及水族魚）、以及所謂之試驗動物（例如倉鼠、天筑鼠、大鼠及小鼠）上之節肢動物。藉控制此等節肢動物，可減輕容易死亡及生產力（對肉、乳、毛、皮、蛋、蜜等）降低，使得藉由使用根據本發明之活性化合物能有更經濟且較容易的動物飼養業。

根據本發明之活性化合物以習知方式被用於獸醫領域及於動物飼養業中，可藉例如錠劑、膠囊、飲劑、獸用藥水、顆粒、糊膏、大丸藥、貫通法及座藥栓劑形式，藉周邊投藥予以使用，例如，藉注射（肌肉內、皮下、靜脈內、腹膜內等）、移植、藉鼻部施用、藉以例如浸泡或浴洗、噴灑、傾注及點擦、洗滌及擦粉以及藉助包含活性化合物之

模塑物件（諸如項圈、耳籤、尾籤、肢體繃帶、韁繩、標記裝置等）之皮膚施用。

當用於家畜、家禽、寵物等時，式(I)之活性化合物可以包含 1 至 80 重量%之活性化合物之調配物（例如粉劑、乳液、自由流動組成物）形式，直接或在 100 至 10000 倍稀釋之後予以使用，或彼等可被用作化學浴劑。

現已進一步地發現到根據本發明之化合物亦具有強力之對抗破壞工業物質之昆蟲的殺昆蟲活性。

下列之昆蟲可被提及作為實例且為較佳者（但非限於）：

蜂類，諸如北美家天牛(Hylotrupes bajulus)、Chloro- phorus pilosis、傢具甲蟲(Anobium punctatum)、Xestobium rufovillosum、Ptilinus pecticornis、Dendrobium pertinex、松芽枝竊蠹(Ernobius mollis)、Priobium carpini、褐粉蠹(Lyctus brunneus)、非洲粉蠹(Lyctus africanus)、南方粉蠹(Lyctus planicollis)、櫟粉蠹(Lyctus linearis)、Lyctus pubescens、Trogoxylon aequale、鱗毛粉蠹(Minthes rugi- collis)、小蠹(Xyleborus)屬、Tryptodendron 屬、咖啡黑長蠹(Apate monachus)、Bostrychus capucins、棕異翅長蠹(Heterobostrychus brunneus)、雙棘長蠹(Sinoxylon)屬、竹蠹(Dinoderus minutus)；

膜翅目昆蟲(Hymenopterons)，諸如藍黑樹蜂(Sirex juvencus)、大樹蜂(Urocerus gigas)、泰加大樹蜂(Urocerus gigas taignus)、樹蜂(Urocerus augur)；

白蟻類，諸如歐洲木白蟻(Kalotermes flavicollis)、麻頭砂蛩(Cryptotermes brevis)、Heterotermes indicola、黃肢散白蟻(Reticulitermes flavipes)、防犀白蟻(Reticulitermes santonensis)、南歐網紋白蟻(Reticulitermes lucifugus)、Mastotennes darwiniensis、南美白蟻(Zootermopsis nevadensis)、家白蟻(Coptotermes formosanus)；

石蛃(Bristletails)，諸如衣魚(Lepisma saccharina)。

本文所述之工業物質應瞭解意表非活體物質，諸如（較佳地）塑膠、黏著劑、塗料、紙及紙板、皮革、毛及加工毛製品及塗覆組成物。

即可用之組成物若適當可另外包含殺昆蟲劑及（若適當）一或多種殺黴菌劑。

關於可能之其他添加劑，可提及上述之殺昆蟲劑及殺黴菌劑。

根據本發明之化合物同樣可被用於保護與鹽水或微鹹水接觸之物體（特別是殼、屏幕、網、建築物、繫船設備及號誌系統）免於污濁。

此外，根據本發明之化合物，單獨或與其他活性化合物組合，可被用作防污劑。

於家庭、衛生及貯存物品之保護方面，活性化合物亦適合用於控制動物害蟲，特別是在密閉空間（例如住宅、工廠走廊、辦公室、汽車車箱等）之昆蟲、蛛形綱動物及蝨。彼等亦可單獨或與其他活性化合物及輔助劑組合，被用於家庭殺昆蟲產品中供控制此等害蟲。彼等對敏感及耐受性之物種且對所有成長階段具有活性。此等害蟲包括：

蠍目，例如地中海黃蠍(Buthus occitanus)。

壁蝨目，例如波斯壁蝨(Argas persicus)、鴿壁蝨(Argas reflexus)、苔蟎(Bryobia)屬、雞刺皮蹣(Dermanyssus gallinae)、住家食甜恙蟲(Glyciphagus domesticus)、Omith- odorus moubat、血紅扇頭蜱(Rhipicephalus sanguineus)、恙蟲(Trombicula alfreddugesi)、Neutrombicula autumnalis、塵蟎(Dermatophagoides pteronissimus)、粉皮蟎(Dermato- phagoides forinae)。

真蜘蛛目，例如捕鳥蛛(Aviculariidae)、金蜘(Araneidae)屬。

盲蛛目，例如螯蠍(Pseudoscorpiones chelifer)、偽蠍(Pseudoscorpiones cheiridium)、盲蛛(Opiliones phalanx- gium)。

等足目，例如土鱉(Oniscus asellus)、鼠婦(Porcellio scaber)。

倍足目，例如斑蛇蜈蚣(Blaniulus guttulatus)、山蛩蟲(Polydesmus)屬。

唇足目，例如蜈蚣(Geophilus)屬

衣魚亞目，例如衣魚(Ctenolepisma)屬、衣魚(Lepisma saccharina)、盜火蟲(Lepismodes inquilinus)。

蜚蠊目，例如、東方蜚蠊(Blatta orientalis)、德國蜚蠊(Blattella germanica)、亞洲蟑螂(Blattella asahinai)、佛羅里達蟑螂(Leucophaea maderae)、古巴蟑螂(Panchlora)屬、 木蟑螂(Parcoblatta)屬、澳洲蜚蠊(Periplaneta austral- lasiae)、美國蜚蠊(Periplaneta Americana)、棕色蜚蠊(Periplaneta brunnea)、黑胸蜚蠊(Periplaneta fuliginosa)、長鬚帶蠊(Supella longipalpa)。

跳躍亞目，例如蟋蟀(Acheta domesticus)。

革翅目，例如地蜈蚣(Forficula auricularia)。

等翅目，例如木白蟻(Kalotermes)屬、散白蟻(Reticuli- termes)屬。

囓蟲目，例如 Lepinatus 屬、書蝨(Liposcelis)屬。

鞘翅目，例如地毯甲蟲(Anthrenus)屬、節蟲(Attagenus)屬、皮蠹(Dermestes)屬、長頭穀盜(Latheticus oryzae)、郭公蟲(Necrobia)屬、蛛蠹(Ptinus)屬、穀蠹(Rhizopertha dominica)、穀象(Sitophilus granaries)、米象(Sitophilus oryzae)、玉米象(Sitophilus zeamais)、藥材甲蟲(Stegobium paniceum)。

雙翅目，例如埃及斑蚊(Aedes aegypti)、白紋伊蚊(Aedes albopictus)、帶喙伊蚊(Aedes taeniorhynchus)、瘧蚊(Ano- pheles)屬、麗蠅(Calliphora erythrocephala)、Chrysozona pluvialis、熱帶家蚊(Culex quinquefasciatus)、 尖音家蚊(Culex pipiens)、媒斑蚊(Culex tarsalis)、果蠅(Drosophila)屬、夏廁蠅(Fannia canicularis)、家蠅(Musca domestica)、白蛉(Phlebotomus)屬、肉蠅(Sarcophaga camaria)、蚋

(Simulium)屬、螯蠅(Stomoxys)屬、廄刺蠅(Stomoxys calcitrans)、沼澤大蚊(Tipula paludosa)。

鱗翅目，例如小蠟蛾(Achroia grisella)、大蠟螟(Galleria mellonella)、印度穀蛾(Plodia interpunctella)、衣蛾(Tinea cloacella)、衣蛾(Tinea pellionella)、带子衣裳飛蛾(Tineola bisselliella)

隱翅目，例如犬蚤(enocephalides canis)、貓蚤(enoce- phalides felis)、人蚤(Pulex irritans)、穿皮潛蚤(Tunga penetrans)、印度鼠蚤(Xenopsylla cheopis)。

膜翅目，例如紅木蟻(Camponotus herculeanus)、黑草蟻(Lasius fuliginosus)、黑花園蟻(Lasius niger)、蔭蟻(Lasius umbratus)、小黃家蟻(Monomorium pharaonis)、Paravespula 屬、鋪道蟻(Tetramorium caespitum)。

蝨目，例如頭蝨(Pediculus humanus capitis)、人體蝨(Pediculus humanus corporis)、Pemphigus 屬、Phylloera vastatrix、陰蝨(Phthirus pubis)。

異翅亞目，例如熱帶臭蟲(Cimex hemipterus)、溫臭蟲(Cimex lectularius)、Rhodinus prolixus、錐椿象(Triatoma infestans)。

在家庭用殺蟲劑方面，彼等可單獨或與其他適合之活性化合物，例如磷酸酯、胺基甲酸酯類、擬除蟲菊酯、新類尼古丁類、生長調節劑，或由其他已知類別之殺昆蟲劑而來之活性化合物組合予以使用。

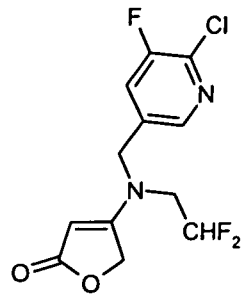
彼等可被用於氣溶膠、無壓噴霧產品（例如唧筒及微粒化噴霧）、自動噴霧劑、泡沫劑、凝膠、由纖維素或聚合物所製得之具蒸發劑錠劑之蒸發器產品、液體蒸發器、凝膠及膜蒸發器、推進劑-驅動之蒸發器、無能量或被動式蒸發系統、蛀蟲紙及蛀蟲膠中，以顆粒或粉劑形式用於供散佈餌劑或用於餌台中。

【實施方式】

製備實施例：

方法 1

4-[[(6-氯-5-氟-吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)胺基]呋喃-2 (5H)-酮

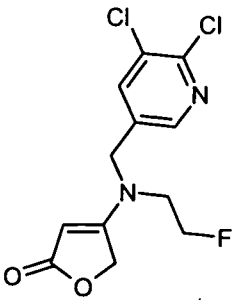


實施例(1)

將317毫克(1.41毫莫耳)之N-[(6-氯-5-氟-吡啶-3-基)甲基]-2,2-二氟乙胺(III-1)添加至173毫克(1.69毫莫耳)於400微升乙酸中之特窗酸中，將此混合物在室溫下攪拌6小時。在減壓下濃縮反應混合物，然後將殘餘物區分於二氯甲烷和水之間。以二氯甲烷萃取水相2次以上。以1N之氫氧化鈉水溶液清洗合併有機相並在減壓下濃縮。藉於矽膠上之管柱層析（矽膠60-Merck，顆粒尺寸：0.04至0.063毫米），利用移動相混合物乙酸乙酯：環己烷(3:1)純化殘餘物，獲得316毫克（理論值之64%）之4-[[(6-氯-5-氟-吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)胺基]呋喃-2(5H)-酮。^{1}H-NMR (CD_3CN)：δ [ppm] = 3.60 (td, 2H), 4.54 (s, 2H), 4.75 (s, 1H), 4.80 (s, 2H), 6.04 (tt, 1H), 7.54 (d, 1H), 8.15 (s, 1H)。

方法 3

4-[[(5,6-二氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)胺基]呋喃-2(5H)-酮



實施例(2)

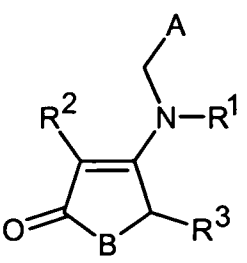
將於100毫升四氫呋喃中之217毫克（1.49毫莫耳）之4-[(2-氟乙基)胺基]呋喃-2 (5H)-酮(VI-1)和90毫克(2.24毫莫耳)之於礦物油中之60%強度氫化鈉分散液於迴流下加熱2小時。於冷卻至室溫之後，添加360毫克（1.49毫莫耳）之3-(溴甲基)-5,6-二氯吡啶，並在迴流下再加熱3小時。於冷卻至室溫及添加甲醇之後，在減壓下濃縮反應混合物。將殘餘物收集於乙酸乙酯中，連續以1N氫氯酸清洗2次，以1N氫氧化鈉水溶液及飽和氯化鈉清洗2次並通過硫酸鈉乾燥。於減壓下濃縮有機相及藉於矽膠上之管柱層析（矽膠60-Merck，顆粒尺寸：0.04至0.063毫米），利用移動相混合物乙酸乙酯：環己烷（5：1）純化殘餘物之後，獲得260毫克（理論值之56%）之4-[[(5,6-二氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)胺基]呋喃-2(5H)-酮。

^{1}H-NMR (CD_3CN)：δ [ppm] = 3.50 (dt, 2H), 4.49 (s, 2H), 4.55 (dt, 2H), 4.64 (s, 1H), 4.80 (s, 2H), 7.80 (s, 1H), 8.22 (s, 1H)。

列於表1中之式(I)之化合物(3)至(7)亦以類似此程序予以製備。

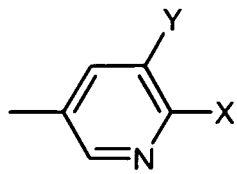
表 1

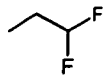
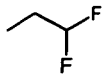
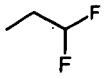
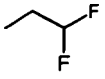
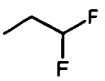
式(I)化合物



(I)

其中 A=



Ex. No.	B	R^1	R^2	R^3	X	Y	物理數據: ^{1}H-NMR, δ [ppm]
3	O		H	H	Cl	Cl	CD_3CN, δ = 3.59 (td, 2H), 4.52 (s, 2H), 4.75 (s, 1H), 4.80 (s, 2H), 6.04 (tt, 1H), 7.80 (s, 1H), 8.22 (s, 1H)
4	O		H	H	Cl	CH_3	CD_3CN, δ = 2.35 (s, 3H), 3.57 (td, 2H), 4.48 (s, 2H), 4.75 (s, 1H), 4.80 (s, 2H), 6.02 (tt, 1H), 7.54 (s, 1H), 8.11 (s, 1H)
5	O		H	H	Cl	Br	CD_3CN, δ = 3.60 (td, 2H), 4.50 (s, 2H), 4.75 (s, 1H), 4.80 (s, 2H), 6.04 (tt, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.25 (s, 1H)
6	O		H	H	Br	Cl	CD_3CN, δ = 3.60 (td, 2H), 4.50 (s, 2H), 4.75 (s, 1H), 4.80 (s, 2H), 6.04 (tt, 1H), 7.75 (s, 1H), 8.20 (s, 1H)
7	O		H	H	Br	F	CD_3CN, δ = 3.61 (td, 2H), 4.53 (s, 2H), 4.75 (s, 1H), 4.80 (s, 2H), 6.04 (tt, 1H), 7.47 (d, 1H), 8.14 (s, 1H)

起始物質之製備

式(HN(R^1)-CH_2-A) (III)

III-1

N-[(6-氯-5-氟-吡啶-3-基)甲基]-2,2-二氟乙胺

在45℃下，將520毫克（2.89毫莫耳）之6-氯-3-氯甲基-5-氟吡啶(VII-3)、1.05毫升（14.44毫莫耳）之2,2-二氟乙胺和400微升（2.89毫莫耳）之三乙胺攪拌於50毫升乙腈中約48小時。於約16及32小時後，分別添加0.42毫升（5.78毫莫耳）之2,2-二氟乙胺。在減壓下濃縮反應混合物之後，將殘餘物收集於1N含水氫氯酸中，並以乙酸乙酯清洗混合物。利用2.5 N氫氧化鈉水溶液使水相成為鹼性，並重覆以乙酸乙酯萃

取。將合併之有機相通過硫酸鈉乾燥並於減壓下濃縮，獲得370毫克（理論值之57%）之N-[(6-氯-5-氟-吡啶-3-基)甲基]-2,2-二氟乙胺。

^{1}H-NMR (CD_3CN)：δ [ppm] = 2.95 (td, 2H), 3.87 (s, 2H), 5.87 (tt, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.17 (s, 1H)。

式(VI)化合物

VI-1

4-[(2-氟乙基)胺基]呋喃-2(5H)-酮

於一水分離器中，將550毫克（4.97毫莫耳）之2-氟乙胺氯化氫、547毫克（5.47毫莫耳）之特窗酸、408毫克（4.97毫莫耳）乙酸鈉及9毫克（0.05毫莫耳）之於50毫升甲苯中之4-甲苯磺酸於迴流下加熱5小時。在減壓下濃縮反應混合物，將殘餘物收集於乙酸乙酯中，並以1N氫氧化鈉水溶液清洗混合物。重覆以乙酸乙酯萃取水相及將合併之有機相通過硫酸鈉乾燥。於減壓下濃縮有機相，藉由乙酸乙酯／環己烷之再結晶純化殘餘物，獲得300毫克（理論值之42%）之4-[(2-氟乙基)胺基]呋喃-2(5H)-酮。

^{1}H-NMR (CD_3CN, δ, ppm) = 3.40 (dq, 2H), 4.52 (dt, 2H), 4.61 (s, 1H), 4.62 (s, 2H), 5.80 (br.s,1H)。

化合物(VI-2)亦可類似於此程序予以製備。

VI-2

4-[(2,2-二氟乙基)胺基]呋喃-2(5H)-酮

^{1}H-NMR (CD_3CN, δ, ppm) = 3.50 (tm, 2H), 4.65 (s, 2H), 4.71 (s, 1H), 5.78 (br.s, 1H), 5.98 (tt,1H)。

式(E-CH_2-A)化合物(VII)

VII-1

(5,6-二氯吡啶-3-基)甲醇（E=OH，A=5,6-二氯吡啶-3-基）（參見 Graf 等人之 Prakt. Chem. 1932，134 177-87）

在0℃下，逐滴添加859毫升(859毫莫耳)之1M硼烷-四氫呋喃複合物於四氫呋喃中之溶液至110克（573毫莫耳）之於250毫升四氫呋喃中之5,6-二氯菸鹼酸。加溫混合物至室溫並在此溫度下攪拌3小時。於冷卻至0℃之後，以飽和之碳酸鉀水溶液使反應混合物成為鹼性，利用旋轉蒸發器去除大部分之四氫呋喃並重覆以乙酸乙酯萃取殘餘物。以水及飽和氯化鈉水溶液清洗合併之有機相並通過硫酸鈉乾燥。在減壓下濃縮有機相並藉於矽膠上之管柱層析（矽膠60-Merck，顆粒尺寸：0.04至0.063毫米），利用移動相混合物乙酸乙酯：環己烷（1：2）純化殘餘物，獲得62克（理論值之61%）之(5,6-二氯吡啶-3-基)甲醇。

^{1}H-NMR (CD_3CN)：δ [ppm] = 3.31 (t, 1H), 4.60 (d, 2H), 7.85 (s, 1H), 8.26 (s, 1H)。

表3之化合物(VII-5)亦可類似於化合物(VII-1)之程序予以製備。

VII-2

3-溴甲基-5,6-二氯吡啶（E=Br，A=5,6-二氯吡啶-3-基）（參見 WO 2000046196 A1）

在0℃下，添加16.40克（62.52毫莫耳）之三苯膦和11.66克（65.50毫莫耳）之N-溴琥珀醯亞胺至10.60克（59.55毫莫耳）之(5,6-二氯吡啶-3-基)甲醇(VII-1)於100毫升二氯甲烷中之溶液中。於2小時後，實質濃縮反應混合物並藉於矽膠上之管柱層析（矽膠60-Merck，顆粒尺寸：0.04至0.063毫米），利用移動相混合物乙酸乙酯：環己烷（1：5）純化殘餘物。獲得12.4克（理論值之86%）之3-溴甲基-5,6-二氯吡啶。

^{1}H-NMR (CD_3CN)：δ [ppm] = 4.53 (s, 2H), 7.97 (s, 1H), 8.35 (s, 1H)。

表3之化合物(VII-6)至(VII-8)亦可類似於化合物(VII-2)之程序予以製備。

VII-3

6-氯-3-氯甲基-5-氟吡啶（E=Cl，A=6-氯-5-氟吡啶-3-基）

將於100毫升氯苯中之1.00克（6.87毫莫耳）之6-氯-5-氟-3-甲基吡啶（參見F. L. Setliff之有機性製備及程序，International 1971, 3, 217-222）、1.01克（7.56毫莫耳）之N-溴琥珀醯亞胺和0.11克（0.69毫莫耳）22'-偶氮雙(2-甲基丙腈)於迴流下煮沸6小時。以飽和之亞硫酸鈉水溶液及碳酸氫鈉溶液清洗反應混合物，然後通過硫酸鈉乾燥，並於減壓下濃縮。藉於矽膠上之管柱層析（矽膠60-Merck，顆粒尺寸：0.04至0.063毫米）殘餘物，利用移動相混合物乙酸乙酯：環己烷（1：20），獲得0.65克（理論值之53%）之6-氯-3-氯甲基-5-氟吡啶。

^{1}H-NMR (CD_3CN)：δ [ppm] = 4.68 (s, 2H), 7.69 (d, 1H), 8.27 (s, 1H)。

VII-4

6-溴-3-溴甲基-5-氟吡啶（E=Br，A=6-溴-5-氟吡啶-3-基）

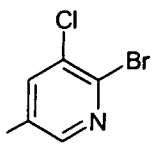
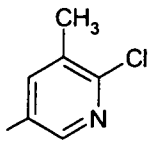
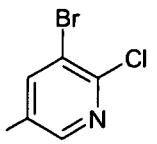
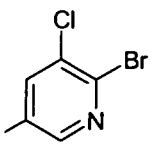
將於1公升氯苯中之10.00克（52.63毫莫耳）之6-溴-5-氟-3-甲基吡啶（參見F. L. Setliff之有機性製備及程序，International 1971, 3, 217-222）、12.18克（68.42毫莫耳）之N-溴琥珀醯亞胺和0.86克（5.26毫莫耳）22'-偶氮雙(2-甲基丙腈)於迴流下煮沸6小時。以飽和之亞硫酸鈉水溶液及碳酸氫鈉溶液清洗反應混合物，然後通過硫酸鈉乾燥，並於減壓下濃縮。藉於矽膠上之管柱層析（矽膠60- Merck，顆粒尺寸：0.04至0.063毫米）殘餘物，利用移動相混合物乙酸乙酯：環己烷（1：20），獲得6.0克（理論值之42%）之6-溴-3-氯甲基-5-氟吡啶。

^{1}H-NMR (CD_3CN)：δ [ppm] = 4.55 (s, 2H), 7.65 (d, 1H), 8.27 (s, 1H)。

其他式(VII)之化合物(VII-5)至(VII-8)被列於下表3。

表 3

E-CH_2-A (VII)

Ex. No.	E	A	物理數據 [a)]
VII-5	OH		3.30 (t, 1H), 4.59 (d, 2H), 7.83 (s, 1H), 8.26 (s, 1H)
VII-6	Br		2.37 (s, 3H), 4.52 (s, 2H), 7.70 (s, 1H), 8.24 (s, 1H)
VII-7	Br		4.52 (s, 2H), 8.10 (s, 1H), 8.38 (s, 1H)
VII-8	Br		4.52 (d, 2H), 7.92 (s, 1H), 8.35 (s, 1H)

生物實例

實施例 1

桃蚜試驗(MYZUPE 噴霧處理)

溶劑：　78 重量份之丙酮

1.5 重量份之二甲基甲醯胺

乳化劑：　0.5 重量份之烷基芳基聚乙二醇醚

為製造一適當之活性化合物之製備物，將1重量份之活性化合物與

所述量之溶劑和乳化劑混合，並以含乳化劑之水將濃縮物稀釋至期望之濃度。

以期望濃度之活性化合物之製備物噴灑被全齡之綠桃蚜蟲(*Myzus persicae*)侵襲之大白菜(*Brassica pekinensis*)。

在期望時間之後，測量作用%。100%表示所有之蚜蟲被殺死；0%表示無蚜蟲被殺死。

在此試驗中，例如下列之製備實施例之化合物顯示優越的活性：見表。

實施例	活性化合物濃度 以克/公頃計	於 5 天後之致死率 以%計
實施例 1	500	100
實施例 2	500	100
實施例 3	500	100
實施例 4	500	100
實施例 5	500	100
實施例 6	500	100
實施例 7	500	100

實施例 2

褐飛蝨(Nnilaparvata lugens)試驗(NILALU 水耕處理)

溶劑：　78 重量份之丙酮

1.5 重量份之二甲基甲醯胺

乳化劑：　0.5 重量份之烷基芳基聚乙二醇醚

為製造一適當之活性化合物之製備物，將1重量份之活性化合物與

所述量之溶劑和乳化劑混合，並以含乳化劑之水將濃縮物稀釋至期望之濃度。

將活性化合物之製備物吸入水中。所述濃度代表每體積單位水之活性化合物之量（毫克／升= ppm）。然後以褐飛蝨(*Nnilaparvata lugens*)污染水。

在期望時間之後，測量作用%。100%表示所有之飛蝨被殺死；0%表示無飛蝨被殺死。

在此試驗中，例如下列之製備實施例之化合物顯示優越的活性：見表。

實施例	活性化合物濃度 以克/公頃計	於 7 天後之致死率 以%計
實施例 2	100	80
實施例 3	100	100

實施例 3

煙草粉蝨(Bemisia tabaci)(BEMITA 噴霧處理)

溶劑：　78 重量份之丙酮

1.5 重量份之二甲基甲醯胺

乳化劑：　0.5 重量份之烷基芳基聚乙二醇醚

為製造一適當之活性化合物之製備物，將1重量份之活性化合物與所述量之溶劑和乳化劑混合，並以含乳化劑之水將濃縮物稀釋至期望之濃度。

以期望濃度之活性化合物之製備物噴灑受粉蝨(*Bemisia tabaci*)幼蟲侵襲之棉葉盤。

在期望時間之後，測量作用%。100%表示所有之粉蝨被殺死；0

%表示無粉蝨被殺死。

在此試驗中，例如下列之製備實施例之化合物顯示優越的活性：見表。

實施例	活性化合物濃度 以克/公頃計	於 7 天後之致死率 以%計
實施例 1	500	100

實施例 4

根瘤線蟲(Meloidogyne)試驗(MELGIN 噴霧處理)

溶劑：　　80 重量份之丙酮

為製造一適當之活性化合物之製備物，將1重量份之活性化合物與所述量之溶劑和乳化劑混合，並以含乳化劑之水將濃縮物稀釋至期望之濃度。

將容器充滿沙子、活性化合物溶液、南方根結線蟲(Meloidogyne incognita)蛋／幼蟲懸浮液及萵苣種子。萵苣種子發芽且長成植物。在根部形成蟲癭。

在期望時間之後，殺線蟲活性係藉蟲癭形成之%予以測定。100%表示未發現蟲癭；0%表示在未處理植物上之蟲癭數相當於未處理之控制組之數目。

在此試驗中，例如下列之製備實施例之化合物顯示優越的活性：見表。

實施例	活性化合物濃度 以 ppm 計	於 14 天後之致死率 以%計
實施例 2	20	100

實施例 5

桃蚜試驗，水耕處理(MYZUPE sys.)

溶劑：　　7 重量份之二甲基甲醯胺

乳化劑：　　2 重量份之烷基芳基聚乙二醇醚

為製造一適當之活性化合物之製備物，將1重量份之活性化合物與所述量之溶劑和乳化劑混合，並以水將濃縮物稀釋至期望之濃度。

將活性化合物之製備物與水混合。所述濃度代表每體積單位水之活性化合物之量（毫克／升=ppm）。將經處理之水填入一罩住一隨後經綠桃蚜蟲(*Myzus persicae*)侵襲之豆科植物（碗豆(*Pisum sativum*)）之容器中。

在期望時間之後，測量致死%。100%表示所有之蚜蟲被殺死；0%表示無蚜蟲被殺死。

在此試驗中，例如下列之製備實施例之化合物顯示優越的活性：見表。

實施例	活性化合物濃度 以 ppm 計	於 6 天後之致死率 以%計
實施例 2	20	100

實施例 6

棉蚜試驗(APHIGO)

溶劑：　　7 重量份之二甲基甲醯胺

乳化劑：　　2 重量份之烷基芳基聚乙二醇醚

為製造一適當之活性化合物之製備物，將1重量份之活性化合物與所述量之溶劑和乳化劑混合，並以含乳化劑之水將濃縮物稀釋至期望

之濃度。

將受棉蚜(*Aphis gossypii*)嚴重侵襲之棉葉（中國棉花(*Gossypium hirsutum*)）藉浸漬於期望濃度之活性化合物之製備物中予以處理。

在期望時間之後，測量致死%。100%表示所有之蚜蟲被殺死；0%表示無蚜蟲被殺死。

在此試驗中，例如下列之製備實施例之化合物顯示優越的活性：見表。

實施例	活性化合物濃度 以 ppm 計	於 6 天後之致死率 以%計
實施例 2	100	95

實施例 7

桃蚜試驗(MYZUPE G)

溶劑：　　7 重量份之二甲基甲醯胺

乳化劑：　　2 重量份之烷基芳基聚乙二醇醚

為製造一適當之活性化合物之製備物，將1重量份之活性化合物與所述量之溶劑和乳化劑混合，並以水將濃縮物稀釋至期望之濃度。

以期望濃度之活性化合物之製備物澆灌被綠桃蚜蟲(*Myzus persicae*)嚴重侵襲之甘藍菜(芥藍(*Brassica oleracea*))。

在期望時間之後，測量作用%。100%表示所有之蚜蟲已被殺死；0%表示無蚜蟲被殺死。

在此試驗中，例如下列之製備實施例之化合物顯示優越的活性：見表。

實施例	活性化合物濃度	於 10 天後之致死率

	以 ppm 計	以%計
實施例 2	4	98

實施例 8

棉蚜試驗(APHIGO G)

溶劑：　　7 重量份之二甲基甲醯胺

乳化劑：　　2 重量份之烷基芳基聚乙二醇醚

為製造一適當之活性化合物之製備物，將1重量份之活性化合物與所述量之溶劑和乳化劑混合，並以水將濃縮物稀釋至期望之濃度。

以期望濃度之活性化合物之製備物澆灌受棉蚜(*Aphis gossypii*)嚴重侵襲之棉花植物(中國棉花(*Gossypium hirsutum*))。

在期望時間之後，測量致死%。100%表示所有之蚜蟲被殺死；0%表示無蚜蟲被殺死。

在此試驗中，例如下列之製備實施例之化合物顯示優越的活性：見表。

實施例	活性化合物濃度 以 ppm 計	於 10 天後之致死率 以%計
實施例 2	4	100

實施例 9

桃蚜試驗（土壤施用）

溶劑：　　4 重量份之丙酮

乳化劑：　　1 重量份之烷基芳基聚乙二醇醚

為製造一適當之活性化合物之製備物，將1重量份之活性化合物與所述量之溶劑和乳化劑混合，並以水將濃縮物稀釋至期望之濃度。

將活性化合物之製備物與土壤混合。所述濃度代表每體積單位土壤之活性化合物之量（毫克／升=ppm）。將經處理之土壤填入一花盆中並種植一鐘形辣椒(番椒(*Capsicum annuum*)。於一週後，以綠桃蚜蟲(*Myzus persicae*)侵襲植物。

在期望時間之後，測量致死%。100%表示所有之蚜蟲被殺死；0%表示無蚜蟲被殺死。

在此試驗中，例如下列之製備實施例之化合物顯示優越的活性：見表。

實施例	活性化合物濃度 以 ppm 計	於 35 天後之致死率 以%計
實施例 4	0.25	90

實施例 10

貓蚤(Ctenocephalides felis)；口服(CTECFE)

溶劑：　　二甲基亞碸

為製造一適當之活性化合物之製備物，將1重量份之活性化合物與所述量之溶劑混合。將部分濃縮物以檸檬酸化之小牛血予以稀釋，製備期望之濃度。

將20隻未被餵食之成蚤（貓蚤）放入一頂部及底端都以紗布封住之小室中。將底端以封口蠟膜封住之金屬圓筒放在小室上。圓筒包含血液／活性化合物之製備物，其可被跳蚤透過封口蠟膜吸取。將血液加溫至37℃，但跳蚤室為在室溫下。

在期望時間之後，測量致死%。100%表示所有之跳蚤被殺死；0%表示無跳蚤被殺死。

在此試驗中，例如下列之製備實施例之化合物顯示優越的活性：

見表。

實施例	活性化合物濃度 以 ppm 計	於 2 天後之致死率 以%計
實施例 1	100	80
實施例 3	100	80
實施例 4	100	80
實施例 6	100	80

實施例 11

家蠅(Lucilia cuprina)試驗(LUCICU)

溶劑：　　二甲基亞碸

為製造一適當之活性化合物之製備物，將1重量份之活性化合物與所述量之溶劑混合，並以水將濃縮物稀釋至期望之濃度。

將內含經期望濃度之活性化合物之製備物處理之馬肉之容器群聚家蠅(*Lucilia cuprina*)幼蟲。

在期望時間之後，測量致死%。100%表示所有之跳蚤被殺死；0%表示無跳蚤被殺死。

在此試驗中，例如下列之製備實施例之化合物顯示優越的活性：見表。

實施例	活性化合物濃度 以 ppm 計	於 2 天後之致死率 以%計
實施例 1	100	100
實施例 7	100	100

實施例 12

微小牛蜱(Boophilus microplus)試驗(BOOPMI 注射)

溶劑：　　二甲基亞碸

為製造一適當之活性化合物之製備物，將1重量份之活性化合物與所述量之溶劑混合，並以溶劑將濃縮物稀釋至期望之濃度。

將活性化合物之溶液注射於腹部(微小牛蜱)，並將動物移入盤中並保持在溫度控制之室內。

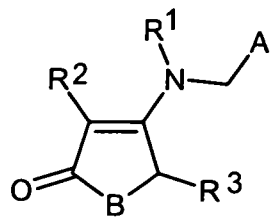
在期望時間之後，測量作用%。100%表示沒有壁蝨能下任何能孵化的蛋。

在此試驗中，例如下列之製備實施例之化合物顯示優越的活性：見表。

實施例	活性化合物濃度 以微克/動物計	於 7 天後之致死率 以%計
實施例 2	20	100

申請專利範圍

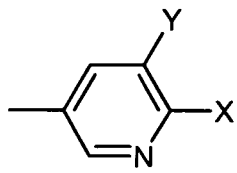
1. 一種製備式(I)化合物之方法，



(I)

其中

A 代表一基團



其中

X 代表鹵素、烷基或鹵烷基，

Y 代表鹵素、烷基、鹵烷基、鹵烷氧基、疊氮基或氰基，

B 代表氧、硫或亞甲基，

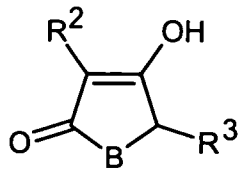
R^1 代表鹵烷基、鹵烯基、鹵環烷基或鹵環烷基烷基，

R^2 代表氫或鹵素，及

R^3 代表氫或烷基，

其中該方法包含

在選自對-甲苯磺酸或乙酸之酸性輔助劑存在下，且若適當，在一適當稀釋劑存在下，將式(II)化合物



(II)

其中 B、R^2 及 R^3 為如上述定義，

與式(III)化合物進行反應，

$HN(R^1)\text{-}CH_2\text{-}A$ (III)

其中 A 及 R^1 為如上述定義。

2. 如請求項第 1 項之方法，其中該適當稀釋劑選自苯、甲苯、氯苯、溴苯、硝基苯或二甲苯。

3. 如請求項第 2 項之方法，其中該反應於 20°C 至 140°C 之溫度進行。

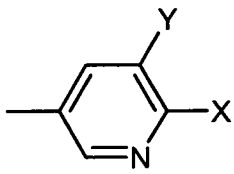
4. 如請求項第 1 項之方法，其中該式(II)化合物為特窗酸(tetronic acid)，且式(III)化合物為 N-[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基]-2,2-二氟乙烷-1-胺。

5. 一種式(III)化合物，

$HN(R^1)\text{-}CH_2\text{-}A$ (III)

其中

A 代表一基團



其中

X 代表鹵素、烷基或鹵烷基，

Y 代表鹵素、烷基、鹵烷基、鹵烷氧基、疊氮基或氰基，且

R^1 代表鹵烷基、鹵烯基、鹵環烷基或鹵環烷基烷基。

6. 如請求項第 5 項之化合物，其為 N-[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基]-2,2-二氟乙烷-1-胺。