



(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 201728568 A

(43)公開日：中華民國 106 (2017) 年 08 月 16 日

(21)申請案號：106102651

(22)申請日：中華民國 106 (2017) 年 01 月 24 日

(51)Int. Cl.：

C07C245/04 (2006.01)

A01N33/26 (2006.01)

A01P7/00 (2006.01)

(30)優先權：2016/01/25

美國

62/286,631

2016/01/25

美國

62/286,642

(71)申請人：陶氏農業科學公司(美國) DOW AGROSCIENCES LLC (US)

美國

(72)發明人：巴頓 湯瑪斯 BARTON, THOMAS (US)；高欣 GAO, XIN (CN)；杭特 吉姆

HUNTER, JIM (US)；利帕雷 保羅 R. LEPLAE, PAUL RENEE (US)；洛 威廉 C.

LO, WILLIAM C. (US)；柏魯瓦 約紹迪普 BORUWA, JOSHODEEP (IN)；坦吉雷

拉 拉古拉姆 TANGIRALA, RAGHURAM (IN)；沃森 傑拉德 B. WATSON,

GERALD B. (US)；赫伯特 約翰 HERBERT, JOHN (US)

(74)代理人：惲軼群；劉法正

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：15 項 圖式數：0 共 232 頁

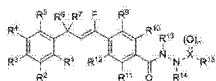
(54)名稱

具有殺蟲效用之分子及與其相關之中間物、組成物及方法(四)

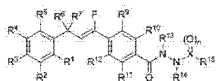
MOLECULES HAVING PESTICIDAL UTILITY, AND INTERMEDIATES, COMPOSITIONS, AND PROCESSES, RELATED THERETO

(57)摘要

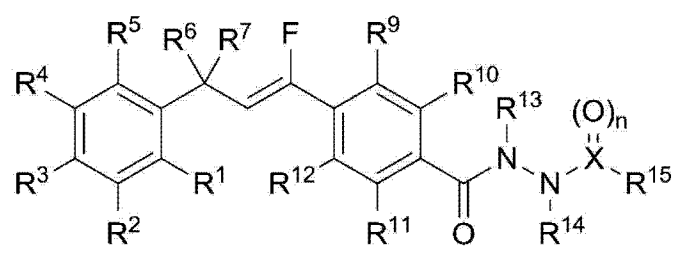
此揭示係有關於下列領域：具有對抗節肢動物門、軟體動物門，及圓形動物門之害蟲之殺蟲效用的分子、生產此類分子之方法、此類方法中使用的中間物、含有此等分子之組成物，以及使用此等分子及組成物對抗此種害蟲之方法。這些分子及組成物可使用作為舉例而言，殺蟬蟎劑、殺昆蟲劑、殺蟎劑、殺軟體動物劑，及殺線蟲劑。本文件揭示具有下式(“式 1”)之分子。



This disclosure relates to the field of molecules having pesticidal utility against pests in Phyla Arthropoda, Mollusca, and Nematoda, processes to produce such molecules, intermediates used in such processes, compositions containing such molecules, and processes of using such molecules and compositions against such pests. These molecules and compositions may be used, for example, as acaricides, insecticides, miticides, molluscicides, and nematocides. This document discloses molecules having the following formula (“Formula One”).



特徵化學式：



式1

【發明摘要】

【中文發明名稱】

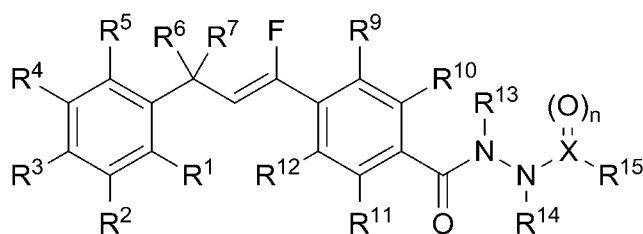
具有殺蟲效用之分子及與其相關之中間物、組成物及方法(四)

【英文發明名稱】

MOLECULES HAVING PESTICIDAL UTILITY, AND INTERMEDIATES, COMPOSITIONS, AND PROCESSES, RELATED THERETO

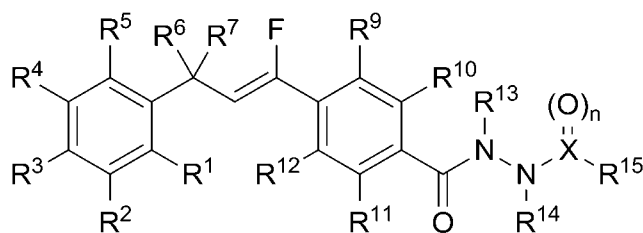
【中文】

此揭示係有關於下列領域：具有對抗節肢動物門、軟體動物門，及圓形動物門之害蟲之殺蟲效用的分子、生產此類分子之方法、此類方法中使用的中間物、含有此等分子之組成物，以及使用此等分子及組成物對抗此種害蟲之方法。這些分子及組成物可使用作為舉例而言，殺蜚蠊劑、殺昆蟲劑、殺蟎劑、殺軟體動物劑，及殺線蟲劑。本文件揭示具有下式(“式1”)之分子。



【英文】

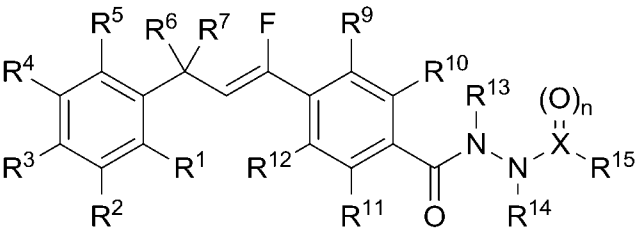
This disclosure relates to the field of molecules having pesticidal utility against pests in Phyla Arthropoda, Mollusca, and Nematoda, processes to produce such molecules, intermediates used in such processes, compositions containing such molecules, and processes of using such molecules and compositions against such pests. These molecules and compositions may be used, for example, as acaricides, insecticides, miticides, molluscicides, and nematicides. This document discloses molecules having the following formula (“Formula One”).



【指定代表圖】(無)

【代表圖之符號簡單說明】
(無)

【特徵化學式】



式1

【發明說明書】

【中文發明名稱】

具有殺蟲效用之分子及與其相關之中間物、組成物及方法(四)

【英文發明名稱】

MOLECULES HAVING PESTICIDAL UTILITY, AND
INTERMEDIATES, COMPOSITIONS, AND PROCESSES,
RELATED THERETO

【技術領域】

【0001】 相關申請案之交叉引述

此申請案主張2016年1月25日提申之美國專利臨時申請案第62/286631號及第62/286642號之利益及優先權，其等各者在此明確地併入以作為參考資料。

【0002】 此揭示係有關於下列領域：具有對抗節肢動物門、軟體動物門，及圓形動物門之害蟲之殺蟲效用的分子，生產此類分子之方法、使用於此類方法中之中間物、含有此等分子之殺蟲組成物，以及使用此等殺蟲組成物對抗此種害蟲之方法。這些殺蟲組成物可使用作為舉例而言，殺蜚蟪劑、殺昆蟲劑、殺蟪劑、殺軟體動物劑，及殺線蟲劑。

【先前技術】

【0003】 “許多最危險的人類疾病是由昆蟲媒介傳播的”(Rivero等人)。“由歷史上來看，瘧疾、登革熱、黃熱病、鼠疫、絲蟲病、蝨傳斑疹傷寒、錐蟲病(trypansomiasis)、萊什曼病(leishmaniasis)和其他病媒感染疾病，較其他原因引起更多的人類疾病與死亡，自17

至20世紀初期”(Gubler)。病媒感染疾病佔全球寄生蟲病與傳染病約17%。僅僅瘧疾每年便造成超過800,000人死亡，這些死亡者有85%為五歲以下之孩童。每年約有五千萬至一億件案例之登革熱出血。每年發生另外的250,000至500,000件案例之登革熱出血(Matthews)。病媒防治在預防與控制感染性疾病方面扮演相當重要的角色。然而，殺蟲劑抗性包括多重殺蟲劑抗性，在人類疾病主要病媒之所有昆蟲物種上愈來愈嚴重(Rivero等人)。近來，超過550個節肢動物物種業已發展出對至少一種殺蟲劑之抗性(Whalon等人)。

【0004】 每年昆蟲、植物病原體與雜草破壞了超過40%之所有食物生產量。儘管施用殺蟲劑及使用一系列廣泛的非化學控制，諸如輪作及生物控制，但此損失仍存在。若僅僅此食物中的一些可保存，便可用於供養世界上超過三十億營養不良的人口(Pimental)。

【0005】 植物寄生線蟲為分佈最廣的害蟲之一，且常常為最隱伏及代價高的害蟲之一。據估計，由於線蟲造成之損失，在已開發國家為約9%，在未開發國家為約15%。然而，在美國，根據35個州對於各種作物之調查顯示，線蟲衍生之損失高達25%(Nicol等人)。

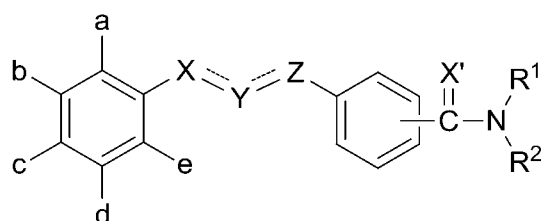
【0006】 值得注意的是，腹足類(蛞蝓和蝸牛)為經濟重要性低於其他的節肢動物或線蟲的害蟲，但在某些地方，腹足類可能會實質上大量降低產率，嚴重影響收穫產品的品質，以及會傳播人類、動物及植物疾病。雖然只有

幾十種腹足類是嚴重地區性害蟲，但有少數品種是世界範圍內的重要害蟲。特別是，腹足類影響廣泛多種農業和園藝作物，如耕地、牧場、和纖維作物；蔬菜；灌木和喬木果實；草本植物；以及觀賞植物(Speiser)。

【0007】白蟻會造成各種私人和公共建築，以及農業和林業資源損害。據估計，在2005年，白蟻造成每年全世界損失超過500億美元(Korb)。

【0008】因此，就許多理由，包括上述之該等理由，持續需要昂貴的(估計於2010年每害蟲為大約2億5千6百萬美元)、耗時的(每害蟲平均為大約10年)，以及困難開發的新穎殺蟲劑(CropLife America)。

【0009】DeMassey等人揭示下列結構。更多詳細信息，請參閱US 2002/0068838。



此揭示引用的某些參考文獻

【0010】CropLife America, **The Cost of New Agrochemical Product Discovery, Development & Registration, and Research & Development predictions for the Future**, 2010.

Gubler, D., **Resurgent Vector-Borne Diseases as a Global Health Problem**, *Emerging Infectious Diseases*, Vol. 4, No. 3, p. 442-450, 1998.

Korb, J., **Termites**, *Current Biology*, Vol. 17, No. 23, 2007.

Matthews, G., **Integrated Vector Management: Controlling Vectors of Malaria and Other Insect Vector Borne Diseases**, Ch. 1, p. 1- 2011.

Nicol, J., Turner S.; Coyne, L.; den Nijs, L., Hockslan, L., Tahna-Maafi, Z., **Current Nematode Threats to World Agriculture**, *Genomic and Molecular Genetics of Plant – Nematode Interactions*, p.21-43, 2011).

Pimental, D., **Pest Control in World Agriculture**, *Agricultural Sciences* - Vol. II, 2009.

Rivero, A., Vezilier, J., Weill, M., Read, A., Gandon, S., **Insect Control of Vector-Borne Diseases: When is Insect Resistance a Problem?** *Public Library of Science Pathogens*, Vol. 6, No. 8, p. 1-9, 2010.

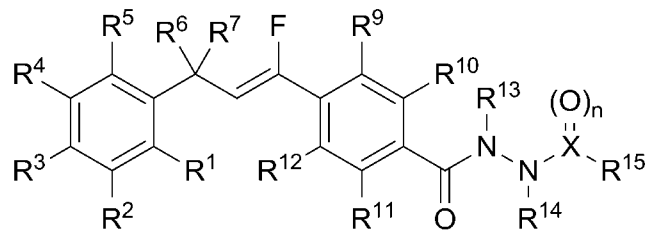
Speiser, B., **Molluscicides**, *Encyclopedia of Pest Management*, Ch. 219, p. 506-508, 2002.

Whalon, M., Mota-Sanchez, D., Hollingworth, R., **Analysis of Global Pesticide Resistance in Arthropods**, *Global Pesticide Resistance in Arthropods*, Ch. 1, p. 5-33, 2008.

【發明內容】

【0011】依據本發明之一實施例，係特地提出一種具下

式之分子



式1

其中：

(A) **R¹**、**R⁵**、**R⁶**、**R¹¹**及**R¹²**各自獨立地選自於下列所構成的群組：H、F、Cl、Br、I、CN、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基，以及(C₁-C₄)鹵烷氧基；

(B) **R²**、**R³**及**R⁴**各自獨立地選自於下列所構成的群組：H、F、Cl、Br、I、CN、(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基，以及(C₁-C₄)鹵烷氧基；

(C) **R⁷**為(C₁-C₆)鹵烷基；

(D) **R⁹**係選自於下列所構成的群組：**(F)**、H、F、Cl、Br、I、CN、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基，以及(C₁-C₄)鹵烷氧基；

(E) **R¹⁰**係選自於下列所構成的群組：**(F)**、F、Cl、Br、I、CN、(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基，以及(C₁-C₄)鹵烷氧基；

(F) **R⁹**及**R¹⁰**能選擇性地一起形成一個3至5員飽和或不飽和的、烴基(hydrocarbyl)鍵聯，

其中該烴基鍵聯可選擇性地以一個或更多個獨立地

選自於下列所構成的群組之取代基予以取代：F、Cl、Br、I及CN；

(G) R^{13} 及 R^{14} 各自獨立地選自於下列所構成的群組：H、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_1-C_4) 鹵烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基，以及 (C_1-C_4) 鹵烷氧基；

(H) X係選自於下列所構成的群組：C、S及P(C_1-C_6)烷基；

(I) n為1或2；

(J) R^{15} 係選自於下列所構成的群組： (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_1-C_4) 鹵烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 鹵烷氧基、苯基及NH(C_1-C_4)鹵烷基，

其中各個烷基、烯基、鹵烷基、烷氧基、鹵烷氧基及苯基可以選擇性地以一個或更多個獨立地選自於下列所構成的群組之取代基予以取代：F、Cl、Br、I、CN及OH；以及

該式1分子之農業上可接受的酸加成鹽類、鹽類衍生物、溶劑合物、酯類衍生物、結晶性多形體、同位素、解析的立體異構物，以及互變異構物。

【實施方式】

【0012】本揭示使用的定義

在此等定義中所提供之範例一般而言並非非窮舉性的，且不得解釋為限制本揭示。應理解，取代基應依從與其所連接的特定分子相關之化學鍵結規則及立體相容性的限制。此等定義僅用於本揭示的目的。

【0013】「活性成分」係意指一種材料，其具有控制害蟲有用的活性，及/或其有用於協助其他材料有更好的控制害蟲之活性，此等材料的實例包括但不限於：殺蜚蠊劑、除藻劑、殺鳥劑(avicide)、殺菌劑、殺真菌劑、除草劑、殺昆蟲劑、殺蟎劑、殺線蟲劑、滅鼠劑、殺病毒劑、拒食劑、驅鳥劑、化學絕育劑、除草劑安全劑、誘蟲劑、驅蟲劑、驅哺乳動物劑、交配干擾劑、植物活化劑、植物生長調節劑，以及協力劑。此等材料的特定實例包括但不限於活性成分群組 α 之中列出的材料。

【0014】「活性成分群組 α 」(此後稱為“AIGA”)係集體意指下列材料：

(1) (3-乙氧基丙基)溴化汞、1,2-二溴乙烷、1,2-二氯乙烷、1,2-二氯丙烷、1,3-二氯丙烯、1-MCP、1-甲基環丙烯、1-萘酚、2-(辛基硫基)乙醇、2,3,3-TPA、2,3,5-三碘苯甲酸、2,3,6-TBA、2,4,5-T、2,4,5-TB、2,4,5-TP、2,4-D、2,4-DB、2,4-DEB、2,4-DEP、2,4-DES、2,4-DP、2,4-MCPA、2,4-MCPB、2iP、2-甲氧基乙基氯化汞、2-苯基酚、3,4-DA、3,4-DB、3,4-DP、3,6-二氯2-吡啶甲酸、4-胺基吡啶、4-CPA、4-CPB、4-CPP、4-羥基苯乙醇、8-羥基喹啉硫酸鹽、8-苯基汞氧基喹啉、阿巴美丁(abamectin)、阿巴美丁胺甲基(abamectin-aminomethyl)、脫落酸(abscisic acid)、ACC、毆殺松(acephate)、亞醯蟎(acequinocyl)、亞滅培(acetamiprid)、家蠅磷(acethion)、乙草胺(acetochlor)、三氯殺蟲酯

(acetofenate)、乙酯磷(acetophos)、乙醯蟲腈(acetoprole)、阿拉酸式苯(acibenzolar)、亞喜芬(acifluorfen)、苯草醚(aclonifen)、ACN、內醯吡庚胺(acrep)、阿納寧(acrinathrin)、丙烯醛(acrolein)、丙烯腈、阿西佩它克斯(acypetacs)、阿斐多匹朋(afidopyropen)、阿福藍(afoxolaner)、拉草(alachlor)、納得爛(alanap)、棉鈴威(alanycarb)、阿苯達唑(albendazole)、得滅克(aldicarb)、得滅克碱、十二嗎啉(aldimorph)、涕滅碱威(aldoxycarb)、阿特靈(aldrin)、亞列寧(allethrin)、蒜素(allicin)、草毒死(allidochlor)、阿洛胺菌素(allosamidin)、亞汰草(alloxydim)、烯丙醇、除害威(allyxycarb)、亞羅列克(alorac)、 α -賽滅寧(***alpha***-cypermethrin)、 α -安殺番(***alpha***-endosulfan)、亞滅寧(alphamethrin)、六甲嘧胺(altretamine)、磷化鋁(aluminium phosphide)、磷化鋁(aluminum phosphide)、辛啞嘧菌胺(ametoctradin)、特津酮(ametridione)、草殺淨(ametryn)、草殺淨(ametryne)、特草嗪酮(amibuzin)、胺啞草酮(amicarbazone)、拌種靈(amicarthiazol)、賽硫磷(amidithion)、磺胺蟎酯(amidoflumet)、醯嘧磺隆(amidosulfuron)、滅害威(aminocarb)、環丙嘧啶酸(aminocyclopyrachlor)、氯胺吡啶酸(aminopyralid)、胺三啞、甲基胺草磷(amiprofos-methyl)、胺草磷(amiprofos)、甲基胺草磷(amiprofos-methyl)、安美速(amisulbrom)、阿米通

(amiton)、三亞蟎(amitraz)、殺草強(amitrole)、胺磺酸鉍鹽、代森鉍(amobam)、非晶形矽膠、非晶形二氧化矽、1- 胺基丙基磷酸 (ampropylfos)、AMS、毒藜鹼(anabasine)、嘧啶醇(ancymidol)、敵菌靈(anilazine)、莎稗磷(anilofos)、疏草隆(anisuron)、蒽醌(anthraquinone)、安妥(antu)、唑磷嗪(apholate)、殺蟎特(aramite)、殘殺威(arprocarb)、三氧化二砷、福美砷(asomate)、阿司匹靈(aspirin)、磺草靈(asulam)、乙基殺撲磷(athidathion)、阿特拉通(atraton)、草脫淨(atrazine)、金色制黴素(aureofungin)、阿維菌素B1(avermectin B1)、AVG、四烯雌酮(aviglycine)、氧環唑(azaconazole)、印苦楝子素(azadirachtin)、草芬定(azafenidin)、亞滅松(azamethiphos)、滅蚜松(azidithion)、四唑嘧磺隆(azimsulfuron)、乙基谷速松(azinphosethyl)、乙基谷速松(azinphos-ethyl)、谷速松(azinphosmethyl)、谷速松(azinphos-methyl)、疊氮津(aziprotryn)、滅蘇民(aziprotryne)、塞侖(azithiram)、偶氮苯(azobenzene)、亞環錫(azocyclotin)、偶氮磷(azothoate)、亞托敏(azoxystrobin)、菊乙胺酯(bachmedesh)、燕麥靈(barban)、燕麥靈(barbanate)、六氟矽酸鋇、多硫化鋇、矽氟化鋇(barium silicofluoride)、椒菊酯(barthrin)、鹼式碳酸銅(basic copper carbonate)、鹼式氯化銅(II)(basic copper chloride)、鹼式硫酸銅(basic copper sulfate)、BCPC、氟丁醯草胺

(beflubutamid)、本達樂(benalaxyl)、本達樂-M、草除靈(benazolin)、醯苯草酮(bencarbazon)、異噻蟲啉(benclothiaz)、苯噻嗪丙酯(bendaqingbingzhi)、免敵克(bendiocarb)、苯達松(bendioxide)、倍尼芬(benefin)、氟草胺(benfluralin)、免扶克(benfuracarb)、呋草黃(benfuresate)、苯嘧磺草胺(benmihuangcaoan)、麥鏽靈(benodanil)、免賴得(benomyl)、解草酮(benoxacor)、苯嘧磷(benoxafos)、醯肟脒(benquinox)、免速隆(bensulfuron)、地散磷(bensulide)、免速達(bensultap)、苯他隆(bentaluron)、本達隆(bentazon)、本達隆(bentazone)、苯噻菌胺(benthiavalicarb)、苯噻硫氰(benthiazole)、(benthiocarb)、草噁嗪(bentrail)、苯甲醯胺氧乙酸(benzadox)、氯化烷基二甲基苄基銨、苯瑪松(benzamacril)、異噁草胺(benzamizole)、抑菌啉(benzamorf)、六氯化苯、雙苯嘧草酮(benzfendizone)、苯甲亞胺(benzimine)、苄草胺(benzipram)、苯并雙環酮(benzobicyclon)、硫丹(benzoepin)、吡草酮(benzofenap)、氟草黃(benzofluor)、苯基異羥肟酸(benzohydroxamic acid)、苯蟬特(benzomate)、苯并磷酸酯(benzophosphate)、苯并噻二啉(benzothiadiaazole)、苯并烯氟菌啉(benzovindiflupyr)、西脫蟬(benzoximate)、新燕靈(benzoylprop)、苯噻隆(benzthiazuron)、苯啉草酮(benzuocaotong)、苯甲酸苄酯、苯甲基腺嘌呤(benzyladenine)、黃連素(berberine)、

β -賽扶寧(*beta*-cyfluthrin)、 β -賽滅寧(*beta*-cypermethrin)、比托沙(bethoxazin)、BHC、雙丙氨磷(bialaphos)、雙環吡喃酮(bicyclopyrone)、必芬蟎(bifenazate)、治草醚(bifenox)、畢芬寧(bifenthrin)、吡氟菌酯(bifujunzhi)、畢拉草(bilanafos)、百蟎克(binapacryl)、病氰硝(bingqingxiao)、百亞列寧(bioallethrin)、苜呋烯菊酯(bioethanomethrin)、生物氯菊酯(biopermethrin)、生物苜呋菊酯(bioresmethrin)、聯苯、吡殺茲(bisazir)、噻枯唑(bismerthiazol)、噻枯唑-銅(bismerthiazol-copper)、雙苯基汞亞甲基二(x-萘-y-磺酸)(bisphenylmercury methylenedi(x-naphthalene-y-sulphonate))、雙草醚(bispyribac)、雙三氟蟲脲(bistrifluron)、殺蟲雙(bisultap)、比多農(bitertanol)、硫雙二氯酚(bithionol)、聯苯吡菌胺(bixafen)、保米黴素(blasticidin-S)、硼砂、波爾多(Bordeaux)混合液、硼酸、白克列(boscalid)、BPPS、芸苔素內酯(brassinolide)、芸苔素內酯-乙基、小蠹集合信息素(brevicommin)、溴鼠隆(brodifacoum)、苜蟎醚(brofenprox)、溴滅菊酯(brofenvalerate)、溴氟苯胺(broflanilide)、溴氟菊酯(brofluthrin)、克草(bromacil)、溴敵隆(bromadiolone)、二溴磷(bromchlophos)、溴鼠胺(bromethalin)、溴苜呋菊酯(bromethrin)、溴苯烯磷(bromfenvinfos)、溴乙醯胺(bromoacetamide)、除草溴(bromobonil)、溴丁醯草胺(bromobutide)、保滿丹(bromociclen)、保滿丹

(bromocyclen) 、 溴 - 滴滴涕 (DDT) 、 溴 酚 肟 (bromofenoxim) 、 溴 磷 松 (bromophos) 、 溴 甲 烷 (bromomethane) 、 溴 磷 松 (bromophos) 、 乙 基 - 溴 磷 松 、 新 殺 蟎 (bromopropylate) 、 溴 菌 腈 (bromothalonil) 、 溴 苯 腈 (bromoxynil) 、 殺 莠 敏 (brompyrazon) 、 溴 克 座 (bromuconazole) 、 溴 硝 醇 (bronopol) 、 BRP 、 BTH 、 增 效 特 (bucarpolate) 、 必 克 蟲 (bufencarb) 、 佈 敏 納 弗 (buminafos) 、 布 瑞 莫 (bupirimate) 、 布 芬 淨 (buprofezin) 、 勃 根 第 (Burgundy) 混 合 液 、 白 消 安 (busulfan) 、 白 消 安 (busulphan) 、 畜 蟲 威 (butacarb) 、 丁 基 拉 草 (butachlor) 、 布 芬 草 (butafenacil) 、 牧 草 胺 (butam) 、 抑 草 磷 (butamifos) 、 丁 烷 - 芬 普 尼 (butane-fipronil) 、 佈 伏 斯 (butathiofos) 、 丁 烯 草 胺 (butenachlor) 、 丁 烷 - 芬 普 尼 (butane-fipronil) 、 苜 蓿 菊 酯 (butethrin) 、 丁 硫 咪 唑 酮 (buthidazole) 、 丁 硫 啶 (buthiobate) 、 丁 噻 隆 (buthiuron) 、 脫 葉 磷 (butifos) 、 佈 嘉 信 (butocarboxim) 、 布 托 酯 (butonate) 、 避 蚊 酮 (butopyronoxyl) 、 丁 酮 砒 威 (butoxycarboxim) 、 比 達 寧 (butralin) 、 丁 三 唑 (butrizol) 、 丁 苯 草 酮 (butoxydim) 、 炔 草 隆 (buturon) 、 丁 基 胺 、 丁 酸 鹽 (butylate) 、 丁 酯 磷 (butylchlorophos) 、 伸 丁 基 - 芬 普 尼 (butylene-fipronil) 、 二 甲 胛 酸 (cacodylic acid) 、 硫 線 磷 (cadusafos) 、 唑 草 胺 (cafenstrole) 、 成 骨 醇 (calciferol) 、 砷 酸 鈣 、 氰 酸 鈣 、 氰 胺 化 鈣 (calcium cyanamide) 、 氰 化 鈣 、 多 硫 化 鈣 、 鈣 殺

畏(calvinphos)、卡本二氯(cambendichlor)、毒殺芬(camphechlor)、樟腦(camphor)、四氯丹(captafol)、蓋普丹(captan)、N-甲基二硫代胺基甲酸(carbam)、嗎菌威(carbamorph)、氯滅殺威(carbanolate)、胺甲萘(carbaril)、胺甲(carbaryl)、除草隆(carbasulam)、卡巴松(carbathion)、貝芬替(carbendazim)、多菌靈(carbendazol)、雙醯草胺(carbetamide)、卡波硫磷(carbofenotion)、加保扶(carbofuran)、二硫化碳、四氯化碳、硫化羰(carbonyl sulfide)、加芬松(carbophenothion)、馬拉硫磷(carbophos)、丁基加保扶(carbosulfan)、羧酸唑(carboxazole)、環二混劑(carboxide)、萎鏽靈(carboxin)、克繁草(carfentrazone)、加普胺(carpropamid)、培丹(cartap)、香芹酚(carvacrol)、香芹酮(carvone)、CAVP、CDAA、CDEA、CDEC、滅胞素(cellocidin)、CEPC、西拉洛(ceralure)、敵菌脲(cerenox)、沙巴達(cevadilla)、切欣特混合液(Cheshunt mixture)、愛卡士(chinalphos)、愛卡士-甲基(chinalphos-méthyl)、蟎離丹(chinomethionat)、滅蟎猛(chinomethionate)、愛卡士(chiralaxyl)、殼聚糖(chitosan)、克氯綜(chlobenthiazone)、甲氧基護谷(chlomethoxyfen)、氯醛糖(chloralose)、克爛本(chloramben)、氯胺磷(chloramine phosphorus)、氯黴素(chloramphenicol)、雙胺靈(chloraniformethan)、克氯尼(chloranil)、丁醯草

胺(chloranocryl)、剋安勃(chlorantraniliprole)、炔禾靈(chlorazifop)、可樂津(chlorazine)、氯殺蟎(chlorbenside)、滅幼脲(chlorbenzuron)、冰片丹(chlorbicyclen)、滅落寧(chlorbromuron)、氯草靈(chlorbufam)、可氯丹(chlordane)、氯癸酮(chlordecone)、氯苯甲脒(chlordimeform)、氯烯炔菊酯(chlorempenthrin)、玉雄殺(chloretazate)、乙烯利(chlorethephon)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、氯特龍(chloreturon)、伐草克(chlorfenac)、克凡派(chlorfenapyr)、2-(2-氯苯基)-1H-苯并咪唑(chlorfenazole)、殺蟎醇(chlorfenethol)、滅草隆(chlorfenidim)、燕麥酯(chlorfenprop)、殺蟎酯(chlorfenson)、敵蟎丹(chlorfensulphide)、氯芬松(chlorfenvinphos)、氯芬松-甲基(chlorfenvinphos-methyl)、克福隆(chlorfluazuron)、氟咪殺(chlorflurazole)、氯甲丹(chlorflurecol)、氯芴酸(chlorfluren)、整形醇(chlorflurenol)、氯草敏(chloridazon)、氯嘧磺隆(chlorimuron)、氯化物(chlorinate)、氯苯胺靈(chlor-IPC)、氯甲磷(chlormephos)、矮壯素陽離子(chlormequat)、磺草酮(chlormesulone)、甲氧基護谷(chlormethoxynil)、氯乙靈(chlornidine)、全滅草(chlornitrofen)、氯醋酸(chloroacetic acid)、克氯苯(chlorobenzilate)、氯二硝萘(chlorodinitronaphthalene)、殺蟎酯(chlorofénizon)、氯仿、滅蟎脒(chloromebuform)、滅

蟲脲(chloromethiuron)、二氯甲氧苯(chloroneb)、氯鼠
 酮(chlorophacinone)、敵百蟲(chlorophos)、氯化苦
 (chloropicrin)、三氯丙酸(chloropon)、克氯蟊
 (chloropropylate)、四氯異苯腈(chlorothalonil)、氯麥隆
 (chlorotoluron)、枯草隆(chloroxifenidim)、枯草隆
 (chloroxuron)、羥敵草腈(chloroxynil)、矮形磷
 (chlorphonium)、氯辛硫磷(chlorphoxim)、滅蟲吡啶
 (chlorprazophos)、氯普卡(chlorprocarb)、氯普芬
 (chlorpropham)、陶斯松(chlorpyrifos)、甲基陶斯松
 (chlorpyrifos-methyl)、四氯喹噁啉(chlorquinox)、氯磺
 隆(chlorsulfuron)、大克草(chlorthal)、草克樂
 (chlorthiamid)、克硫松(chlorthiophos)、綠麥隆
 (chlortoluron)、克氯得(chlozolate)、乙菌利
 (chltosan)、膽鈣化醇(cholecalciferol)、氯化膽鹼、可芬
 諾(chromafenozide)、環己米特(cicloheximide)、抗倒酯
 (cimectacarb)、抗倒酯(cimetacarb)、瓜菊酯(cinerin)I、
 瓜菊酯II、瓜菊酯類(cinerins)、乙基環鹽草酯
 (cinidon-ethyl)、環庚草醚(cinmethylin)、西速隆
 (cinosulfuron)、津奧啉(cintofen)、苯氰丁鹽胺
 (ciobutide)、落草胺(cisanilide)、順式苧呋菊酯
 (cismethrin)、氯酰草膦(clacyfos)、環苯草酮
 (clefoxydim)、克崙吡林(clenpirin)、克崙吡林
 (clenpyrin)、剋草同(clethodim)、甘寶素(climbazole)、
 氯碘吡啶酯(cliodinate)、炔草酯(clodinafop)、除線威

(cloethocarb) 、 苯 噻 嗪 鉀 (clofencet) 、 滴 滴 涕 (clofenotane) 、 克 芬 蟊 (clofentezine) 、 氯 芬 磷 (clofenvinfos) 、 氯 貝 酸 (clofibric acid) 、 氯 丁 草 (clofop) 、 可 滅 蹤 (clomazone) 、 克 普 草 (clomeprop) 、 氯 硝 柳 胺 (clonitralid) 、 調 果 酸 (cloprop) 、 環 丁 烯 草 酮 (cloproxydim) 、 畢 克 草 (clopyralid) 、 解 毒 嗶 (cloquintocet) 、 氯 酯 磺 草 胺 (cloransulam) 、 氯 氰 碘 柳 胺 (closantel) 、 可 尼 丁 (clothianidin) 、 克 黴 唑 (clotrimazole) 、 座 果 酸 (cloxyfonac) 、 抑 霉 胺 (cloxylacon) 、 抑 霉 胺 (clozylacon) 、 CMA 、 CMMP 、 CMP 、 CMU 、 十 二 碳 二 烯 醇 (codlelure) 、 膽 骨 化 醇 (colecalfiferol) 、 噻 唑 硫 磷 (colophonate) 、 8-羥 基 喹 啉 銅 (copper 8-quinolinolate) 、 乙 酸 銅 、 乙 醯 亞 砷 酸 銅 、 砷 酸 銅 、 碳 酸 銅 、 鹼 式 、 氫 氧 化 銅 、 萘 酸 銅 、 油 酸 銅 、 氯 氧 化 銅 、 矽 酸 銅 、 硫 酸 銅 、 硫 酸 銅 、 鹼 式 、 鉻 酸 銅 鋅 、 氯 殺 鼠 靈 (coumachlor) 、 殺 鼠 靈 (coumafène) 、 庫 馬 磷 (coumafos) 、 克 滅 鼠 (coumafuryl) 、 蠅 毒 磷 (coumaphos) 、 殺 鼠 迷 (coumatetralyl) 、 甲 香 菌 酯 (coumethoxystrobin) 、 畜 蟲 磷 (coumithoate) 、 丁 香 菌 酯 (coumoxystrobin) 、 CPMC 、 CPMF 、 CPPC 、 必 滅 草 (credazine) 、 甲 酚 (cresol) 、 甲 苯 酚 (cresylic acid) 、 甲 基 鼠 滅 定 (crimidine) 、 克 羅 米 通 (crotamiton) 、 丁 烯 磷 (crotoxyfos) 、 丁 烯 磷 (crotoxyphos) 、 育 畜 磷 (crufomate) 、 冰 晶 石 (cryolite) 、 誘 蠅 酮 (cue-lure) 、 銅 合 浦 單 劑 (cufraneb) 、 二 苯 隆

(cumyleron)、草隆(cumyluron)、福美銅氯(cuprobam)、
氧化亞銅、莪術醇(curcumenol)、CVMP、氰胺、氰草淨
(cyanatryn)、 氰 乃 淨 (cyanazine)、 施 力 松
(cyanofenphos)、 氰、 氰 乃 松 (cyanophos)、 果 蟲 磷
(cyanthoate)、 氰蟲醯胺(cyantraniliprole)、三聚氰酸、
賽座滅(cyazofamid)、賽百摧(cybutryne)、環菌胺
(cyclafuramid)、環丙醯胺酸(cyclanilide)、環胺普羅
(cyclaniliprole)、環戊烯菊酯(cyclethrin)、環草敵
(cycloate)、環己醯亞胺(cycloheximide)、環蟎酯
(cycloprate)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、環比瑞摩
(cyclopyrimorate)、環磺隆(cyclosulfamuron)、環殺草
(cycloxydim)、環莠隆(cycluron)、啞蟎氰
(cyenopyrafen)、賽芬胺(cyflufenamid)、賽芬蟎
(cyflumetofen)、賽扶寧(cyfluthrin)、賽伏草
(cyhalofop)、賽洛寧(cyhalothrin)、錫蟎丹(cyhexatin)、
蟎蟬胺(cymiazole)、克絕(cymoxanil)、解草胺腈
(cyometrinil)、伏賜丁(cypendazole)、賽滅寧
(cypermethrin)、牧草快(cyperquat)、賽芬寧
(cyphenothrin)、環丙津(cyprazine)、三環噁草胺
(cyprazole)、環克座(cyproconazole)、賽普洛
(cyprodinil)、酯菌胺(cyprofuram)、環草胺(cypromid)、
環丙磺醯胺(cyprosulfamide)、賽滅淨(cyromazine)、賽
滅磷(cythioate)、賽翠斯(cytrex)、汰草龍(daimuron)、
得拉本(dalapon)、丁醯肼(daminozide)、噻幼酮

(dayoutong)、邁隆(dazomet)、DBCP、*d*-樟腦(*d*-camphor)、DCB、DCIP、DCPA、DCPTA、DCU、DDD、DDPP、DDT、DDVP、咪菌威(debacarb)、癸磷錫(decacafentin)、溴氰菊酯(decamethrin)、去甲基克百威(decarbofuran)、避蚊胺(deet)、去氫乙酸、敵草快(deiquat)、異丁草胺(delachlor)、大克松(delnav)、第滅寧(deltamethrin)、甲基滅賜松(demephion)、甲基滅賜松-O、甲基滅賜松-S、內吸磷(demeton)、甲基內吸磷、內吸磷-O、甲基內吸磷-O、內吸磷-S、甲基內吸磷-S、磯吸磷(demeton-S-methyl sulphon)、磯吸磷(demeton-S-methylsulphon)、DEP、生物丙烯菊酯(depalléthrine)、毒利死(derris)、甜菜安(desmedipham)、敵草淨(desmetryn)、敵草淨(desmetryne)、*d*-反式氯炔丙菊酯(*d*-fanshiluquebingjuzhi)、汰芬隆(diafenthiuron)、氯亞磷(dialifor)、得拉松(dialifos)、燕麥敵(diallate)、除線特(diamidafos)、麥草畏(dianat)、矽藻土(diatomaceous earth)、矽藻土(diatomite)、大利松(diazinon)、二溴磷(dibrom)、酞酸二丁酯、丁二酸二丁酯、汰克草(dicamba)、異氯磷(dicapthon)、二氯苯腈(dichlobenil)、除線磷(dichlofenthion)、益發靈(dichlofluanid)、二氯萘醌(dichlone)、氯全隆(dichloralurea)、滅幼脲(dichlorbenzuron)、敵草隆(dichlorfenidim)、羧酸芴(dichlorflurecol)、二氯甲丹(dichlorflurenol)、芞胺靈(dichlormate)、二氯丙烯胺(dichlormid)、二氯甲烷、二

氯滅座替(dicloromezotiaz)、二氯酚(dichlorophen)、2,4-
 滴丙酸(dichlorprop)、2,4-滴丙酸-P、二氯松
 (dichlorvos)、賜克滅(dichlozolin)、賜克滅
 (dichlozoline)、苳氯三唑醇(diclobutrazol)、雙氯氰菌胺
 (diclocymet)、禾草靈(diclofop)、達滅淨(diclomezine)、
 大克爛(dicloran)、雙氯磺草胺(diclosulam)、大克蟊
 (dicofol)、二氯二苯三氯乙烷(dicophane)、雙香豆素
 (dicoumarol)、大跨希(dicresyl)、雙特松(dicrotophos)、
 地快樂(dicryl)、雙羥香豆素(dicumarol)、環蟲腈
 (dicyclanil)、二環隆(dicyclonon)、地特靈(dieldrin)、
 得氯蟊(dienochlor)、二依馬(diethamquat)、乙醯甲草胺
 (diethatyl)、乙硫磷(diethion)、乙硫磷(diéthion)、乙黴
 威(diethofencarb)、迪艾索諾(dietholate)、迪艾索
 (diéthon)、焦碳酸二乙酯(diethyl pyrocarbonate)、二乙
 甲苯醯胺(diethyltoluamide)、鼠得克(difenacoum)、待
 克利(difenoconazole)、戊味禾草靈(difenopenten)、枯莠
 隆(difenoxuron)、野燕枯(difenzoquat)、噻鼠靈
 (difethialone)、氟蟊吡(diflovidazin)、二福隆
 (diflubenzuron)、吡氟草胺(di flufenican)、吡氟草胺
 (di flufenicanil)、氟吡草腈(di flufenzopyr)、二氟林
 (diflumetorim)、敵草克(dikegulac)、二羥丙茶鹼
 (dilor)、滴馬提夫(dimatif)、四氟甲醚菊酯
 (dimefluthrin)、甲氟磷(dimefox)、啞唑隆(dimefuron)、
 殺蟲雙(dimehypo)、哌草丹(dimepiperate)、菌核淨

(dimetachlone) 、 地 麥 威 (dimetan) 、 混 滅 威 (dimethacarb) 、 菌 核 淨 (dimethachlone) 、 二 甲 草 胺 (dimethachlor) 、 異 戊 乙 淨 (dimethametryn) 、 汰 草 滅 (dimethenamid) 、 汰 草 滅-P 、 噁 節 因 (dimethipin) 、 二 甲 嘧 吩 (dimethirimol) 、 大 滅 松 (dimethoate) 、 達 滅 芬 (dimethomorph) 、 苜 菊 酯 (dimethrin) 、 卡 百 酸 二 甲 酯 (dimethyl carbate) 、 二 硫 二 甲 烷 、 酞 酸 二 甲 酯 、 二 甲 基 亞 硝 胺 (dimethylvinphos) 、 敵 蠅 威 (dimetilan) 、 草 滅 散 (dimexano) 、 草 嗶 酮 (dimidazon) 、 醚 菌 胺 (dimoxystrobin) 、 敵 匹 硫 磷 (dimpylate) 、 殺 草 隆 (dimuron) 、 消 蟊 酚 (dinex) 、 啞 菌 噁 唑 (dingjunezuo) 、 達 克 利 (diniconazole) 、 達 克 利-M 、 撻 乃 安 (dinitramine) 、 二 硝 基 酚 、 大 脫 蟊 (dinobuton) 、 白 粉 克 (dinocap) 、 白 粉 克-4 、 白 粉 克-6 、 敵 蟊 消 (dinocton) 、 地 樂 特 (dinofenate) 、 硝 戊 酯 (dinopenton) 、 硝 丙 酚 (dinoprop) 、 戊 硝 酚 (dinosam) 、 達 諾 殺 (dinoseb) 、 硝 辛 酯 殺 蟊 劑 (dinosulfon) 、 達 特 南 (dinotefuran) 、 特 樂 酚 (dinoterb) 、 硝 丁 酯 (dinoterbon) 、 苯 蟲 醚 (diofenolan) 、 殺 力 松 (dioxabenzofos) 、 二 氧 威 (dioxacarb) 、 敵 殺 磷 (dioxathion) 、 敵 殺 磷 (dioxation) 、 敵 鼠 (diphacin) 、 得 伐 鼠 (diphacinone) 、 得 伐 鼠 (diphenadione) 、 大 芬 滅 (diphenamid) 、 大 芬 滅 (diphenamide) 、 二 苯 砒 、 二 苯 胺 、 硫 化 二 苯 基 (diphenylsulphide) 、 調 呔 酸 (diproglucic acid) 、 胺 樂 靈 (dipropalin) 、 殺 草 淨 (dipropetryn) 、 三 氯

松(dipterex)、大芬滅替松(dipymetitrone)、雙硫氧吡啶(dipyrithione)、大刈特(diquat)、四硼酸二鈉、殺蟲雙(disosultap)、環氧十九烷(disparlure)、麥草畏甲酯(disugran)、賽松(disul)、二硫龍(disulfiram)、二硫松(disulfoton)、普得松(ditalimfos)、腈硫醯(dithianon)、大賽伏(dithicrofos)、二硫醚、甲基乙拌磷(dithiométon)、汰硫草(dithiopyr)、達有龍(diuron)、二黃原酸(dixanthogen)、*d*-檸檬油精(*d*-limonene)、DMDS、DMPA、DNOC、十二環嗎啉(dodemorph)、多地辛(dodicin)、多寧(dodine)、朵芬娜賓(dofenapyn)、多果定(dogvadine)、多明尼卡路(dominicalure)、多滅蟲(doramectin)、DPC、胍菌酮(drazoxolon)、DSMA、右旋反式氯丙炔菊酯(*d-trans*-allethrin)、右旋反式苄呋菊酯(*d-trans*-resmethrin)、毒氟磷(dufulin)、殺草隆(dymron)、EBEP、EBP、克線丹(ebufos)、蛻皮甾酮(ecdysterone)、氯唑靈(echlomezol)、EDB、EDC、EDDP、護粒松(edifenphos)、甘草津(eglinazine)、因滅汀(enamectin)、EMPC、益避寧(empenthrin)、烯腺嘌呤(enadenine)、安殺番(endosulfan)、草多索(endothal)、草多索(endothall)、因毒磷(endothion)、安特靈(endrin)、烯肱菌酯(enestroburin)、恩康唑(enilconazole)、烯肱菌酯(enoxastrobin)、除蟎酯(ephirsulfonate)、EPN、丙醯芸苔素內酯(epocholeone)、保幼醚(epofenonane)、依普座(epoxiconazole)、乙醯胺

基阿維菌素(eprinomectin)、磺唑草(epronaz)、EPTC、抑草蓬(erbon)、鈣化醇(ergocalciferol)、二氯醯草胺(erlujixiancaoan)、富右旋反式丙烯菊酯(esdépalléthrine)、益化利(esfenvalerate)、ESP、禾草畏(esprocarb)、乙烯矽(etacelasil)、乙環唑(etaconazole)、抑他風(etaphos)、益地安(etem)、噻唑菌胺(ethaboxam)、克草胺(ethachlor)、乙丁烯氟靈(ethalfluralin)、胺苯磺隆(ethametsulfuron)、殺草胺(ethaprochlor)、乙烯利(ethephon)、磺噻隆(ethidimuron)、愛芬克(ethiofencarb)、硫草敵(ethiolate)、愛殺松(ethion)、乙嗪草酮(ethiozin)、乙蟲腈(ethiprole)、依瑞莫(ethirimol)、益硫磷(ethoate-methyl)、乙氧苯草胺(ethobenzanid)、益覆滅(ethofumesate)、乙基己二醇(ethohexadiol)、滅克磷(ethoprop)、普伏松(ethoprophos)、氯氟草醚(ethoxyfen)、乙氧基喹啉(ethoxyquin)、亞速隆(ethoxysulfuron)、吲唑酯(ethychlozate)、甲酸乙酯(ethyl formate)、焦磷酸乙酯(ethyl pyrophosphate)、乙滴涕(ethylan)、乙基-DDD、乙烯、二溴化乙烯、二氯化乙烯、環氧乙烷、乙蒜素(ethylicin)、乙基汞2,3二羥基丙基硫醇酯(ethylmercury 2,3-dihydroxypropyl mercaptide)、乙基乙酸汞(ethylmercury acetate)、乙基溴化汞(ethylmercury bromide)、乙基氯化汞、乙基磷酸汞、硝草酚(etinofen)、ETM、乙胺草醚(etnipromid)、

乙氧苯草胺(etobenzanid)、依芬寧(etofenprox)、依殺蟪(etoxazole)、依得利(etridiazole)、益多松(etrifos)、益多松(étrifos)、丁香酚(eugenol)、EXD、凡殺同(famoxadone)、胺磺磷(famphur)、伐草克(fenac)、咪唑菌酮(fenamidone)、敵磺鈉(fenaminosulf)、烯肟菌胺(fenaminstrobin)、芬滅松(fenamiphos)、咪菌腓(fenapanil)、芬瑞莫(fenarimol)、醯苯磺威(fenasulam)、抗蟪唑(fenazaflor)、芬殺蟪(fenazaquin)、芬克座(fenbuconazole)、芬佈賜(fenbutatin oxide)、解草唑(fenchlorazole)、樂乃松(fenchlorphos)、樂乃松(fenchlorfos)、解草啖(fenclorim)、芬硫克(fenethacarb)、五氟苯菊酯(fenfluthrin)、甲呋醯胺(fenfuram)、環醯菌胺(fenhexamid)、非草隆(fenidin)、種衣酯(fenitropan)、撲滅松(fenitrothion)、芬蟪酯(fénizon)、酚菌酮(fenjuntong)、丁基滅必蝨(fenobucarb)、毒菌錫(fenolovo)、2,4,5-涕丙酸(fenoprop)、芬硫克(fenothiocab)、芬噁寧(fenoxacrim)、芬諾尼(fenoxanil)、芬殺草(fenoxaprop)、芬殺草-P、異噁苯磺(fenoxasulfone)、芬諾克(fenoxycarb)、拌種咯(fenpiclonil)、吡氯氰菊酯(fenpirithrin)、芬普寧(fenpropathrin)、苯鏽啖(fenpropidin)、芬普福(fenpropimorph)、胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)、芬普蟪(fenpyroximate)、芬昆諾三酮(fenquinotrione)、殺雄噤(fenridazon)、芬蟪酯

(fenson)、繁福松(fensulfothion)、氯苯氧乙醇(fenteracol)、噻唑禾草靈(fenthiaprop)、芬殺松(fenthion)、乙基芬殺松(fenthion-ethyl)、噻唑禾草靈(fentiaprop)、三苯錫(fentin)、四唑醯草胺(fentrazamide)、芳氟胺(fentrifanil)、非草隆(fenuron)、非草隆TCA、芬化利(fenvalerate)、富爾邦(ferbam)、富米綜(ferimzone)、磷酸鐵、硫酸亞鐵、芬普尼(fipronil)、麥草氟酯(flamprop)、麥草氟酯-M、伏速隆(flazasulfuron)、伏滅鼠(flocoumafen)、弗美托奎(flometoquin)、氟尼胺(flonicamid)、雙氟磺草胺(florasulam)、嘧蟊酯(flucacrypyrim)、伏寄普(fluzifop)、伏寄普-P(fluzifop-P)、扶吉胺(fluzinam)、異丙吡草酯(fluzolate)、氟啶蜚脲(fluzuron)、氟大滅(flubendiamide)、氟苯并胺噻唑(flubenzimine)、溴氟菊酯(flubrocycythrinate)、氟酮磺隆(flucarbazon)、氟吡磺隆(flucetosulfuron)、氟消草(fluchloralin)、伏克隆(flucofuron)、氟蟊脲(flucycloxuron)、護賽寧(flucythrinate)、護汰寧(fludioxonil)、聯氟蟊(fluénéthyl)、聯苯氟(fluenetil)、氟噻蟲磺(fluensulfone)、氟噻草胺(flufenacet)、嘧蟲胺(flufenerim)、弗芬肯(flufenican)、氟芬隆(flufenoxuron)、氟菌蟊酯(flufenoxystrobin)、三氟醚菊酯(flufenprox)、氟噻嗪草酯(flufenpyr)、氟蟊嗪(flufenzine)、丁蟲腈(flufiprole)、氟菲殺磺

(fluhexafon)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、氟噻菌胺(flumetover)、氟節胺(flumetralin)、唑啞磺草胺(flumetsulam)、氟每淨(flumezin)、氟烯草酸(flumiclorac)、丙炔氟草胺(flumioxazin)、炔草胺(flumipropyn)、氟味啉(flumorph)、可奪草(fluometuron)、氟比來(fluopicolide)、氟吡菌噻胺(flupyram)、氟殺蟎(fluorbenside)、增糖胺(fluoridamid)、氟乙噻胺(fluoroacetamide)、氟乙酸(fluoroacetic acid)、氟咯草酮(fluorochloridone)、三氟硝草醚(fluorodifen)、乙羧氟草醚(fluoroglycofen)、氟噻亞胺(fluoroimide)、氟氯菌核利(fluoromide)、唑啞草(fluoromidine)、氟除草醚(fluoronitrofen)、氯氟吡氧乙酸(fluoroxypyr)、殺克丹(fluothiuron)、三氟苯唑(fluotrimazole)、氟噻菌酯(fluxastrobin)、氟胺草唑(flupoxam)、氟異丙嘧草酯(flupropacil)、氟鼠啞(flupropadine)、氟丙酸(flupropanate)、弗比南載夫隆(flupyradifurone)、氟啞嘧磺隆(flupyrsulfuron)、氟喹唑(fluquinconazole)、氟拉藍(fluralaner)、解草安(flurazole)、抑草丁(flurecol)、抑草丁(flurenol)、氟啞草酮(fluridone)、氟咯草酮(flurochloridone)、氟氯嘧定(fluromidine)、氟氯比(fluroxypyr)、呋嘧醇(flurprimidol)、硫氟磺噻胺(flursulamid)、呋草酮(flurtamone)、護矽得(flusilazole)、氟硫滅(flusulfamide)、氟蟎嗪(flutenzine)、氟噻草酯

(fluthiacet)、氟噻草胺(fluthiamide)、氟停安(flutianil)、福多寧(flutolanil)、護汰芬(flutriafol)、福化利(fluvalinate)、氟唑菌醯胺(fluxapyroxad)、肱草安(fluxofenim)、滅菌丹(folpel)、福爾培(folpet)、氟磺胺草醚(fomesafen)、大福松(fonofos)、甲醯胺磺隆(foramsulfuron)、氟吡脲(forchlorfenuron)、甲醛、覆滅蟎(formetanate)、福木松(formothion)、藻蟎威(formparanate)、調節磷(fosamine)、福賽得(fosetyl)、丁苯硫磷(fosmethilan)、甲基氯吡磷(fospirate)、福賽絕(fosthiazate)、丁硫環磷(fosthietan)、弗羅塔林(frontalin)、四氯苯酞(fthalide)、麥穗靈(fuberidazole)、氟草淨(fucaojing)、氟草醚(fucaomi)、氟菌蟎酯(fujunmanzhi)、氟乳醚(fulumi)、薰草呋(fumarin)、氟奈西草林(funaihecaoling)、呋苯硫脲(fuphenthiourea)、乙二醇縮糠醛(furalane)、呋霜靈(furalaxyl)、呋呋菊酯(furamethrin)、福拉比(furametpyr)、呋喃蟲醯肼(furantebufenozide)、呋線威(furathiocarb)、二甲呋醯胺(furcarbanil)、呋菌唑(furconazole)、呋菌唑(furconazole)-順式、糠醛菊酯(furethrin)、糠醛(furfural)、呋喃解草唑(furilazole)、伴種胺(furmecyclox)、呋甲硫菌靈(furophanate)、呋氧草醚(furyloxyfen)、 γ -BHC、 γ -賽洛寧(*gamma*-cyhalothrin)、 γ -HCH、格蟎酯(genit)、赤黴酸(gibberellic acid)、赤黴素A3 (gibberellin A3)、赤黴素(gibberellins)、甘氟

(gliftor)、鼠甘伏(glitor)、氯醛葡萄糖(glucochloralose)、草銨膦(glufosinate)、草銨膦-P、固毆寧(glyodin)、乙二肼(glyoxime)、嘉磷塞(glyphosate)、草甘二膦(glyphosine)、誘蟲十六酯(gossyplure)、誘殺烯混劑(grandlure)、灰黃黴素(griseofulvin)、胍諾克丁(guanoctine)、雙胍辛(guazatine)、丙烯酸喹啉酯(halacrinat)、哈洛昔芬(halauxifen)、合芬寧(halfenprox)、合芬隆(halofenozide)、鹵殺芬(halosafen)、合速隆(halosulfuron)、氟啶草(haloxydine)、合氯氟(haloxifyop)、合氯氟-P、合氯氟-R、HCA、HCB、HCH、六甲蜜胺(hemel)、海母帕(hempa)、HEOD、飛佈達(heptachlor)、烯肼菌(heptafluthrin)、飛達松(heptenophos)、增產肼(heptopargil)、除莠菌素(herbimycin)、除莠菌素A(herbimycin A)、速殺硫磷(heterophos)、六氯(hexachlor)、六六六(hexachloran)、六氯丙酮(hexachloroacetone)、六氯苯、六氯丁二烯、六氯酚(hexachlorophene)、菲克利(hexaconazole)、六伏隆(hexaflumuron)、六伏胺(hexafluoramin)、六氟鹽(hexaflurate)、紅鈴誘烯(hexalure)、己醯胺(hexamide)、菲殺淨(hexazinone)、己硫松(hexylthiofos)、合賽多(hexythiazox)、HHDN、赫洛塞呋(holosulf)、高油菜素內酯(homobrassinolide)、磺硝肼(huancaiwo)、環蟲腈(huanchongjing)、磺草靈(huangcaoling)、環菌唑(huanjunzuo)、愛美隆(hydramethylnon)、汞加芬

(hydrargaphen)、熟石灰(hydrated lime)、氫氰胺(hydrogen cyanamide)、氰化氫(hydrogen cyanide)、烯蟲乙酯(hydroprene)、土菌消(hydroxyisoxazole)、殺紋寧(hymexazol)、水奎威(hyquincarb)、IAA、IBA、IBP、埃卡瑞丁(icaridin)、依滅列(imazalil)、咪草酸(imazamethabenz)、甲氧咪草煙(imazamox)、甲咪唑烟酸(imazapic)、依滅草(imazapyr)、滅草喹(imazaquin)、咪唑乙煙酸(imazethapyr)、依速隆(imazosulfuron)、易胺座(imibenconazole)、新煙鹼類(imicyafos)、益達胺(imidacloprid)、氯噻啉(imidaclothiz)、克熱淨(iminoctadine)、依普寧(imiprothrin)、依納素(inabenfide)、茛草酮(indanofan)、三嗪茛草胺(indaziflam)、因得克(indoxacarb)、枯瘟淨(inezin)、矽藻土(infusorial earth)、碘普尼(iodobonil)、碘卡佈(iodocarb)、丙胺磷(iodofenphos)、碘甲烷(iodomethane)、碘磺隆(iodosulfuron)、碘芬磺隆(iofensulfuron)、碘苯腈(ioxynil)、抑草津(ipazine)、IPC、種菌唑(ipconazole)、鹵苯胺唑(ipfencarbazone)、依普芬三氟康納唑(ipfentrifluconazole)、丙基喜樂松(iprobenfos)、依普同(iprodione)、丙森辛(iprovalicarb)、丙草定(iprymidam)、小蟲二醇烯(ipsdienol)、小蟲醇烯(ipsenol)、IPSP、IPX、依殺米朵孚斯(isamidofos)、依殺松(isazofos)、碳氯靈(isobenzan)、丁咪醯胺(isocarbamid)、丁咪醯胺

(isocarbamide)、水胺硫磷(isocarbophos)、異草定(isocil)、異氯甲橋(isodrin)、亞芬松(isofenphos)、甲基亞芬松、艾索非他米(isofetamid)、異索威(isolan)、丁吡草酮(isomethiozin)、異草完隆(isonoruron)、異潘松(isopamphos)、氮萵草(isopolinate)、滅必蝨(isoprocarb)、異草定(isoprocil)、異丙樂靈(isopropalin)、異丙吡草酯(isopropazol)、亞賜圃(isoprothiolane)、異丙隆(isoproturon)、萘吡菌胺(isopyrazam)、異皮莫(isopyrimol)、獲賜松(isothioate)、異噻菌胺(isotianil)、愛速隆(isouron)、異凡二酮(isovaledione)、異嘮草胺(isoxaben)、異嘮氯草酮(isoxachlortole)、雙苯噁唑酸(isoxadifen)、異嘮唑草酮(isoxaflutole)、異嘮草醚(isoxapyrifop)、加福松(isoxathion)、異噁隆(isuron)、依維菌素(ivermectin)、異嘮草胺(ixoxaben)、淨種磷(izopamfos)、淨種磷(izopamphos)、茉莉油(japonilure)、喃烯菊酯(japothrins)、茉莉菊酯素(jasmolin)I、茉莉菊酯素II、茉莉酸(jasmonic acid)、甲磺蔥脲(jiahuangchongzong)、甲基硝啉(jiajizengxiaolin)、甲香菊酯(jiaxiangjunzhi)、解草完(jiecaowan)、解草稀(jiecaoxi)、井崗黴素A(Jinganmycin A)、護粒松(jodfenphos)、青春激素I(juvenile hormone I)、青春激素II、青春激素III、噻噁菊酯(kadethrin)、κ-畢芬寧(kappa-bifenthrin)、κ-汰福寧(kappa-tefluthrin)、特胺靈(karbutilate)、卡列他南

(karetazan)、嘉賜黴素(kasugamycin)、柯均林(kejunlin)、氯戊環(kelevan)、酮螺氧(ketospiradox)、矽藻土(kieselguhr)、細胞分裂素(kinetin)、烯蟲炔酯(kinoprene)、精苯霜靈(kiralaxyl)、克收欣(kresoxim-methyl)、庫卡辛(kuicaoxi)、乳氟禾草靈(lactofen)、 λ -賽洛寧(*lambda*-cyhalothrin)、拉提路(latilure)、砷酸鉛(lead arsenate)、環草定(lenacil)、里琵菌素(lepimectin)、福賜松(leptophos)、聯苯肼酯(lianbenjingzhi)、石灰硫磺(lime sulfur)、靈丹(lindane)、雷尼汀(lineatin)、理有龍(linuron)、力輪松(lirimfos)、利露(litlure)、誘池蛾酯(looplure)、祿芬隆(lufenuron)、氯醯草膦(lüxiancaolin)、氯啉菌酯(lvdingjunzhi)、氯氟醚菊酯(lvfumijvzhi)、氯醯草膦(lvxiancaolin)、噻唑磷(lythidathion)、M-74、M-81、MAA、磷化鎂、馬拉松(malathion)、麥迪遜(maldison)、順丁烯二醯肼(maleic hydrazide)、特蟎腈(malonoben)、麥芽糊精(maltodextrin)、MAMA、代森錳銅(mancopper)、鋅錳乃浦(mancozeb)、曼戴克敏(mandestrobin)、曼普胺(mandipropamid)、錳乃浦(maneb)、苦參鹼(matrine)、疊氮磷(mazidox)、MCC、MCP、MCPA、硫乙基MCPA、MCPB、MCPB、巴斯丹(mebenil)、滅加松(mecarbam)、苯并威(mecarbinzid)、四甲磷(mecarphon)、2-甲-4-氯丙酸(mecoprop)、2-甲-4-氯丙酸-P、殺蟎脒(medimeform)、地樂施(medinoterb)、

誘殺酯 (medlure)、滅芬草 (mefenacet)、右滅達樂 (mefenoxam)、吡唑二酸 (mefenpyr)、氟磺醯草胺 (mefluidide)、十四碳二烯酸 (megatomoic acid)、蜜蠟醇、雙薰草素醇 (melitoxin)、MEMC、美納松 (menazon)、MEP、滅派林 (mepanipyrin)、氯氟醚菊酯 (meperfluthrin)、甲苯諾 (mephenate)、美福松 (mephosfolan)、甲哌啉 (mepiquat)、滅普寧 (mepronil)、敵蟪普 (meptyldinocap)、滅蟲威 (mercaptodimethur)、倍硫磷 (mercaptophos)、內吸磷 (mercaptophos thiol)、馬拉硫磷 (mercaptothion)、氯化汞、氧化汞、氯化亞汞、脫葉亞磷 (merphos)、脫葉亞磷氧化物 (merphos oxide)、滅莠津 (mesoprazine)、磺胺磺隆 (mesosulfuron)、硝磺草酮 (mesotrione)、甲硫酚 (mesulfen)、倍硫磷亞砷 (mesulfenfos)、每蘇芬 (mesulphen)、間甲酚 (metacresol)、美氟綜 (metaflumizone)、滅達樂 (metalaxyl)、右滅達樂 (metalaxyl-M)、聚乙醛 (metaldehyde)、斯美地 (metam)、噁唑醯草胺 (metamifop)、苯吡草酮 (metamitron)、偏磷酸鈣 (metaphos)、興豐寶 (metaxon)、滅草胺 (metazachlor)、雙醚氯吡嘧磺隆 (metazosulfuron)、間氯敵菌酮 (metazoxolon)、滅特座 (metconazole)、甲基涕巴 (metepa)、二甲噻草伏 (metflurazon)、甲基苯噻隆 (methabenzthiazuron)、滅克松 (methacrifos)、甲基丙樂靈 (methalpropalin)、威百畝 (metham)、達馬松

(methamidophos)、滅速克(methasulfocarb)、滅草啞(methazole)、呋菌胺(methfuroxam)、甲基苯噻隆(methibenzuron)、滅大松(methidathion)、甲硫苯威(methiobencarb)、滅賜克(methiocarb)、甲硫嘧磺隆(methiopyrisulfuron)、甲硫涕巴(methiotepa)、美西除靈(methiozolin)、滅草恆(methiuron)、殺蟲乙烯磷(methocrotophos)、速滅威(métholcarb)、醚草通(methometon)、納乃得(methomyl)、美賜平(methoprene)、蓋草津(methoprotryn)、格草淨(methoprotryne)、喹啉羧酸-丁基(methoquin-butyl)、甲醚菊酯(methothrin)、甲氧滴滴涕(methoxychlor)、滅芬諾(methoxyfenozide)、去草酮(methoxyphenone)、甲基啞磷嗪(methyl apholate)、溴甲烷、甲基丁香粉(methyl eugenol)、碘甲烷(methyl iodide)、異硫氰酸甲酯(methyl isothiocyanate)、甲基巴拉松(methyl parathion)、甲基乙酯磷(methylacetophos)、甲氯仿、甲基二硫胺甲酸(methyldithiocarbamic acid)、甲基殺草隆(methyldymron)、二氯甲烷、甲基亞芬松(methyl-isofenphos)、甲基倍硫磷(methylmercaptophos)、甲基倍硫磷氧化物(methylmercaptophos oxide)、甲基內吸磷(methylmercaptophos thiol)、甲基苯甲酸汞(methylmercury benzoate)、甲基汞二氰二胺(methylmercury dicyandiamide)、甲基五氯苯氧化汞(methylmercury pentachlorophenoxide)、亞甲癸醯胺

(methylneodecanamide)、殺螟硫磷(methylnitrophos)、保棉磷(methyltriazothion)、唑嘧磺草胺(metiozolin)、免得爛(metiram)、免得爛鋅(metiram-zinc)、吡喃隆(metobenzuron)、撲奪草(metobromuron)、美特寧(metofluthrin)、莫多草(metolachlor)、治滅蟲(metolcarb)、苯磺隆(metometuron)、苯氧菌胺(metominostrobin)、磺草唑胺(metosulam)、呋蟲酮(metoxadiazone)、甲氧隆(metoxuron)、滅芬農(metrafenone)、代森聯(metriam)、滅必淨(metribuzin)、敵百蟲(metrifonate)、敵百蟲(metriphonate)、噁菌胺(metsulfovax)、磺隆(metsulfuron)、美文松(mevinphos)、治克威(mexacarbate)、滅除威(miechuwei)、邁森(mieshuan)、滅蚊菊酯(miewenjuzhi)、密滅汀(milbemectin)、倍脈心(milbemycin oxime)、代森環(milneb)、噁蟎胺(mima2nan)、丙胺氟磷(mipafox)、MIPC、滅蟻樂(mirex)、MNAF、蘑菇醇(moguchun)、稻得壯(molinate)、殺蟲單(molosultap)、氧苄氟菊酯(momfluorothrin)、庚醯草胺(monalide)、莫尼速隆(monisuron)、單甲脒(monoamitraz)、一氯乙酸、亞素靈(monocrotophos)、綠谷龍(monolinuron)、殺蟲單(monomehypo)、舒非侖(monosulfiram)、單嘧磺隆(monosulfuron)、殺蟲單(monosultap)、滅草隆(monuron)、滅草隆TCA、伐草快(morfamquat)、嗎啉胍

(moroxydine)、茂硫磷(morphothion)、墨茲(morzid)、莫西菌素(moxidectin)、MPMC、MSMA、MTMC、誘蟲烯(muscalure)、邁克尼(myclobutanil)、滅克寧(myclozolin)、三十醇(myricyl alcohol)、*N*-(乙基汞)-對-甲苯磺醯胺苯、NAA、NAAm、代森鈉(nabam)、萘肼磷(naftalofos)、乃力松(naled)、萘、萘乙醯胺、萘二甲酸酐(naphthalic anhydride)、萘酞磷(naphthalophos)、萘氧乙酸、萘乙酸、萘啉烷-1,3-二酮(naphthylindane-1,3-diones)、萘氧基乙酸(naphthyloxyacetic acids)、萘丙胺(naproanilide)、滅落脫(napropamide)、滅落脫-M(napropamide-M)、納得爛(naptalam)、納他黴素(natamycin)、NBPOS、草不隆(neburea)、草不龍(neburon)、安特靈(nendrin)、新菸鹼、尼克羅福(nichlorfos)、除草醚(niclofen)、氯硝柳胺(niclosamide)、啞醯菌胺(nicobifen)、煙嘧磺隆(nicosulfuron)、尼古丁、硫酸菸鹼(nicotine sulfate)、伏蟻靈(nifluridide)、尼克黴素(nikkomycins)、NIP、吡氯草胺(nipyraclofen)、氟氯草胺(nipyraclofen)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、硝乙脲噻唑(nithiazine)、滅殺草(nitralin)、氯啞(nitrapyrin)、戊氰威(nitrilacarb)、護谷(nitrofen)、三氟甲草醚(nitrofluorfen)、硝苯乙烯(nitrostyrene)、酞菌酯(nitrothal-isopropyl)、鼠特靈(nobormide)、壬醇、鼠特靈(norbormide)、草完隆(norea)、氟草敏(norflurazon)、降菸鹼(nornicotine)、草

完隆 (noruron) 、 諾伐隆 (novaluron) 、 多氟脲 (noviflumuron) 、 NPA 、 尼瑞莫 (nuarimol) 、 諾瑞隆 (nuranone) 、 OCH 、 八氯二丙基醚 、 辛噻酮 (octhilinone) 、 鄰二氯苯 (*o*-dichlorobenzene) 、 呋醯胺 (ofurace) 、 歐滅松 (omethoate) 、 鄰苯基苯酚 、 坪草丹 (orbencarb) 、 歐弗拉洛 (orfralure) 、 坪草丹 (orthobencarb) 、 鄰二氯苯 (*ortho*-dichlorobenzene) 、 噻苯胺磺隆 (orthosulfamuron) 、 歐塔路 (oryctalure) 、 肟醚菌胺 (orysastrobin) 、 歐拉靈 (oryzalin) 、 王草腦 (osthol) 、 王草腦 (osthole) 、 歐斯措莫 (ostramone) 、 除蟎酯 (ovatron) 、 蟎淨 (ovex) 、 解草腈 (oxabetrinil) 、 丙炔啉草酮 (oxadiargyl) 、 樂滅草 (oxadiazon) 、 毆殺斯 (oxadixyl) 、 草氨酸酯 (oxamate) 、 歐殺滅 (oxamyl) 、 草噻松 (oxapyrazon) 、 草噻松 (oxapyrazone) 、 環氧噻磺隆 (oxasulfuron) 、 奧賽普林 (oxathiapiprolin) 、 啞吡草酮 (oxaziclomefone) 、 快得寧 (oxine-copper) 、 快得寧 (oxine-Cu) 、 歐索林酸 (oxolinic acid) 、 啞咪唑 (oxpoconazole) 、 嘉保信 (oxycarboxin) 、 滅多松 (oxydemeton-methyl) 、 異亞砒磷 (oxydeprofos) 、 砒拌磷 (oxydisulfoton) 、 羥烯腺嘌呤 (oxyenadenine) 、 復祿芬 (oxyfluorfen) 、 氧化苦參鹼 (oxymatrine) 、 土黴素 (oxytetracycline) 、 滅蟎猛 (oxythioquinox) 、 PAC 、 巴克素 (paclobutrazol) 、 哌蟲啉 (paichongding) 、 亞烈寧 (palléthrine) 、 PAP 、 對-二氯苯 (*para*-dichlorobenzene) 、 對氟隆 (parafluron) 、 巴拉刈 (paraquat) 、 巴拉松

(parathion)、甲基巴拉松、苯吡醇(parinol)、巴黎綠(Paris green)、PCNB、PCP、PCP-Na、對-二氯苯(*p*-dichlorobenzene)、PDJ、克草猛(pebulate)、消蟪酚(pédinex)、披扶座(pefurazoate)、壬酸(pelargonic acid)、平克座(penconazole)、賓克隆(pencycuron)、施得圃(pendimethalin)、半滴乙酯(penfenate)、戊苯吡菌胺(penflufen)、氟幼脲(penfluron)、二甲戊靈(penoxalin)、平速爛(penoxsulam)、五氯酚(pentachlorophenol)、月桂酸五氯苯酯(pentachlorophenyl laurate)、甲氯醯草胺(pentanochlor)、噻菌胺(penthiopyrad)、百滅寧(pentmethrin)、環戊嘮草酮(pentoxazone)、滅蟻靈(perchlordecone)、苯氟磺安(perfluidone)、百滅寧(permethrin)、烯草胺(pethoxamid)、PHC、氰烯菌胺(phenamacril)、乙基氰烯菌胺(phenamacril-ethyl)、敵磺鈉(phénaminosulf)、葉枯淨(phenazine oxide)、酚那卡貝(phénétacarbe)、棉胺寧(phenisopham)、芬硫磷(phenkapton)、甜菜寧(phenmedipham)、乙基甜菜寧、醯草隆(phenobenzuron)、酚硫殺(phenothiol)、酚丁滅寧(phenothrin)、苯蟪醚(phenproxide)、賽達松(phenthioate)、苯基汞脲(phenylmercuriurea)、苯基乙酸汞(phenylmercury acetate)、苯基汞氯化物(phenylmercury chloride)、焦兒茶酚之苯基汞衍生物(phenylmercury derivative of pyrocatechol)、硝酸苯汞

(phenylmercury nitrate)、苯基汞水楊酸鹽
 (phenylmercury salicylate)、福瑞松(phorate)、毒鼠磷
 (phosacetim)、裕必松(phosalone)、特丁淨
 (phosametine)、毒鼠磷(phosazetim)、毒鼠磷
 (phosazetin)、三磷錫(phoscyclotin)、氯瘟磷
 (phosdiphen)、乙磷(phosethyl)、硫環磷(phosfolan)、
 硫環磷-甲基(phosfolan-methyl)、甘胺硫磷
 (phosglycin)、益滅松(phosmet)、對氯硫磷
 (phosnichlor)、磷醯胺(phosphamide)、福賜米松
 (phosphamidon)、磷、草丁磷(phosphinothricin)、磷克
 (phosphocarb)、磷、三磷錫(phostin)、巴賽松(phoxim)、
 甲基巴賽松、熱必斯(phthalide)、亞胺硫磷
 (phthalophos)、胺菊酯(phthalthrin)、皮卡布西
 (picarbutrazox)、避卡蚋叮(picaridin)、畢克爛
 (picloram)、氟吡醯草胺(picolinafen)、啞氧菌酯
 (picoxystrobin)、鏈黴菌素(pimaricin)、殺鼠酮
 (pindone)、啞啞草酯(pinoxaden)、哌丙靈(piperalin)、
 哌啉(piperazine)、胡椒基丁氧化物、胡椒基環己烯酮
 (piperonyl cyclonene)、哌草磷(piperophos)、哌壯素
 (piproctanly)、哌壯素(piproctanyl)、增效醛(piprotal)、
 必美松(pirimetaphos)、比加普(pirimicarb)、滅鼠優
 (piriminil)、啞啞氧磷(pirimioxyphos)、必滅松
 (pirimiphos-ethyl)、亞特松(pirimiphos-methyl)、殺鼠
 酮(pival)、殺鼠酮(pivaldione)、三氯殺三氯酯

(plifenate)、PMA、PMP、聚丁烯(polybutenes)、聚胺甲酸酯(polycarbamate)、多氯化苄烯(polychlorcamphene)、聚乙氧基喹啉(polyethoxyquinoline)、保粒黴素D (polyoxin D)、保粒黴素(polyoxins)、保粒黴素丁(polyoxorim)、多噻烷(polythialan)、亞砷酸鉀(potassium arsenite)、疊氮化鉀(potassium azide)、氰酸鉀、乙基黃原酸鉀(potassium ethylxanthate)、環烷酸鉀(potassium naphthenate)、多硫化鉀(potassium polysulfide)、硫氰酸鉀(potassium thiocyanate)、4,4-滴滴涕(pp'-DDT)、普亞烈寧(prallethrin)、早熟素I(precocene I)、早熟素II、早熟素III、普拉草(pretilachlor)、嘧啶松(primidophos)、氟嘧磺隆(primisulfuron)、撲殺熱(probenazole)、撲克拉(prochloraz)、丙氯醇(proclonol)、丙腈津(procyazine)、撲滅寧(procymidone)、氨氟樂靈(prodiamine)、佈飛松(profenofos)、氟唑草胺(profluazol)、環丙氟靈(profluralin)、丙氟菊酯(profluthrin)、氯苯噻草酮(profoxydim)、殺蟲安(profurite-aminium)、丙草止津(proglinazine)、調環酸(prohexadione)、茉莉酮(prohydrojasmon)、蜚虱威(promacyl)、普滅克(promecarb)、撲滅通(prometon)、佈滅淨(prometryn)、佈滅淨(prometryne)、捕滅鼠(promurit)、拿草特(pronamide)、雷蒙得(propachlor)、丙蟲磷(propafos)、普羅帕脒(propamidine)、普拔克(propamocarb)、除草寧(propanil)、加護松(propaphos)、普拔草

(propaquizafop) 、 毆 蟪 多 (propargite) 、 撲 蟲 菊 (proparthrin) 、 普 拔 根 (propazine) 、 撲 達 松 (propetamphos) 、 苯 胺 靈 (propham) 、 普 克 利 (propiconazole) 、 羥 吡 酯 (propidine) 、 甲 基 鋅 乃 浦 (propineb) 、 異 丙 草 胺 (propisochlor) 、 安 丹 (propoxur) 、 丙 苯 磺 隆 (propoxycarbazone) 、 丙 基 增 效 劑 (propyl isome) 、 吡 啶 啞 啞 磺 隆 (propyrisulfuron) 、 戊 炔 草 胺 (propyzamide) 、 丙 氧 喹 啉 (proquinazid) 、 骨 酯 素 (prosuler) 、 甲 硫 磺 樂 靈 (prosulfalin) 、 苜 草 丹 (prosulfocarb) 、 三 氟 丙 磺 隆 (prosulfuron) 、 乙 噻 啞 磷 (prothidathion) 、 胺 丙 威 (prothiocarb) 、 丙 硫 菌 啞 (prothioconazole) 、 普 硫 松 (prothiofos) 、 飛 克 松 (prothoate) 、 丙 苯 煙 菊 酯 (protrifenbute) 、 撲 滅 生 (proxan) 、 吡 啞 丹 磷 (prymidophos) 、 丙 炔 草 胺 (prynachlor) 、 補 骨 脂 素 (psoralen) 、 補 骨 脂 素 (psoralene) 、 吡 達 農 (pydanon) 、 派 福 布 敏 (pyflubumide) 、 派 滅 淨 (pymetrozine) 、 賜 加 落 (pyracarbolid) 、 白 克 松 (pyraclofos) 、 雙 啞 草 腈 (pyraclonil) 、 百 克 敏 (pyraclostrobin) 、 派 芬 草 (pyraflufen) 、 必 伏 清 (pyrafluprole) 、 啞 啞 威 (pyramat) 、 啞 胺 菌 酯 (pyrametostrobin) 、 啞 菌 酯 (pyraoxystrobin) 、 磺 醯 草 吡 啞 (pyrasulfotole) 、 必 記 福 敏 (pyraziflumid) 、 吡 啞 特 (pyrazolate) 、 苜 草 啞 (pyrazolynate) 、 殺 草 敏 (pyrazon) 、 白 粉 松 (pyrazophos) 、 百 速 隆

(pyrazosulfuron)、彼硫磷(pyrazothion)、普芬草(pyrazoxyfen)、吡菊酯(pyresmethrin)、除蟲菊精I、除蟲菊精II、除蟲菊精類、草醚-異丙基(pyribambenz-isopropyl)、草醚-丙基(pyribambenz-propyl)、吡菌苯威(pyribencarb)、嘧啶肟草醚(pyribenzoxim)、稗草丹(pyributicarb)、氯草定(pyriclor)、畢達本(pyridaben)、噻草福(pyridafol)、啖蟲丙醚(pyridalyl)、必芬松(pyridaphenthion)、必芬松(pyridaphenthione)、必汰草(pyridate)、雙滴保(pyridinitril)、比芬諾(pyrifenox)、氟蟲吡啶(pyrifluquinazon)、環酯草醚(pyriftalid)、吡嘧他磷(pyrimétaphos)、派美尼(pyrimethanil)、抗蚜威(pyrimicarbe)、畢汰芬(pyrimidifen)、嘧草醚(pyriminobac)、嘧蟎胺(pyriminostrobin)、乙基嘧啶磷(pyrimiphos-éthyl)、甲基嘧啶磷(pyrimiphos-méthyl)、吡嘧蘇芬(pyrimisulfan)、嘧硫磷(pyrimitate)、滅鼠優(pyrinuron)、甲氧苯啖菌(pyriofenone)、必清(pyriprole)、吡啖醇(pyripropanol)、百利普芬(pyriproxyfen)、啖菌噁唑(pyrisoxazole)、嘧硫草醚(pyrithiobac)、吡啖威(pyrolan)、百快隆(pyroquilon)、吡啖磺(pyroxasulfone)、甲氧磺草胺(pyroxsulam)、氯甲氧吡啖(pyroxychlor)、氯吡根呋醚(pyroxyfur)、嗒草酸(qincaosuan)、青枯靈(qingkuling)、苦木(quassia)、嗒烯酮(quinacetol)、拜裕松(quinalphos)、甲基拜裕松、醌

菌脞(quinazamid)、快克草(quinclorac)、喹克座(quinconazole)、氯甲喹啉酸(quinmerac)、滅藻醃(quinoclamine)、滅蟪猛(quinomethionate)、氯藻胺(quinonamid)、畜寧磷(quinothion)、快諾芬(quinoxifen)、喹硫磷(quintiofos)、五氯硝苯(quintozene)、快伏草(quizalofop)、快伏草-P、驅蚊酯(quwenzhi)、驅蠅啖(quyingding)、吡咪唑(rabenzazole)、碘醚柳胺(rafoxanide)、R-達克利(R-diniconazole)、二乙基苯甲醃胺(rebemide)、敵草快(reglone)、瑞毒隆(renriduron)、列卡路(rescalure)、列滅寧(resmethrin)、硫氰苯胺(rhodethanil)、鬧羊花毒素-III(rhodojaponin-III)、病毒唑(ribavirin)、碨密磺隆(rimsulfuron)、丁蟲腈(rizazole)、R-滅達樂(R-metalaxyl)、硫氰苯胺(rodéthanil)、皮蠅磷(ronnel)、魚藤酮(rotenone)、蘭尼汀(ryania)、沙巴黎蘆(sabadilla)、嘧啖肱草醚(saflufenacil)、噻菌茂(saijunmao)、噻森銅(saisentong)、柳醃胺苯、氟矽菊酯(salifluofen)、血根鹼(sanguinarine)、山道年(santonin)、右亞列寧(S-bioallethrin)、八甲焦磷醃胺(schradan)、海蔥糖苷(scilliroside)、另丁津(sebuthylazine)、仲丁通(secbumeton)、環丙吡菌胺(sedaxane)、色拉菌素(selamectin)、單甲咪(semiamitraz)、增效菊(sesamex)、芝麻啉(sesamolin)、西松(sesone)、西殺草(sethoxydim)、西維因(sevin)、雙

甲 胺 草 磷 (shuangjiaancaolin) 、 雙 甲 胺 草 磷
 (shuangjianancaolin) 、 S-烯蟲乙酯(S-hydroprene) 、 環
 草 隆 (siduron) 、 西 福 明 津 治 (sifumijvzhi) 、 誘 蟲 環
 (siglure) 、 矽 護 芬 (silaflluofen) 、 雜 氮 矽 三 環 (silatrane) 、
 矽 氣 凝 膠 (silica aerogel) 、 矽 膠 、 矽 噻 菌 胺 (silthiofam) 、
 矽 噻 菌 胺 (silthiopham) 、 矽 噻 菌 胺 (silthiophan) 、 2,4,5-
 涕 丙 酸 (silvex) 、 草 滅 淨 (simazine) 、 矽 氟 唑
 (simeconazole) 、 西 瑪 通 (simeton) 、 西 草 淨 (simetryn) 、
 西 草 淨 (simetryne) 、 殺 雄 啉 (sintofen) 、 S-烯蟲炔酯
 (S-kinoprene) 、 熟 石 灰 (slaked lime) 、 SMA 、 S-美賜平
 (S-methoprene) 、 左 旋 莫 多 草 (S-metolachlor) 、 亞 砷 酸
 鈉 、 疊 氮 化 鈉 、 氯 酸 鈉 、 氰 化 鈉 、 氟 化 鈉 、 氟 乙 酸 鈉 、 六
 氟 矽 酸 鈉 、 環 烷 酸 鈉 (sodium naphthenate) 、 鄰 苯 基 苯 酚
 化 鈉 (sodium *o*-phenylphenoxide) 、 鄰 苯 基 苯 酚 化 鈉
 (sodium orthophenylphenoxide) 、 五 氯 酚 鈉 (sodium
 pentachlorophenate) 、 五 氯 酚 鈉 (sodium
 pentachlorophenoxide) 、 多 硫 化 鈉 (sodium
 polysulfide) 、 氟 矽 酸 鈉 (sodium silicofluoride) 、 四 硫 代
 硫 酸 鈉 (sodium tetrathiocarbonate) 、 硫 氰 酸 鈉 、 斯 隆
 (solan) 、 蘇 硫 磷 (sophamide) 、 賜 諾 特 (spinetoram) 、 賜
 諾 殺 (spinosad) 、 賜 派 芬 (spirodiclofen) 、 螺 甲 蟎 酯
 (spiromesifen) 、 螺 蟲 乙 酯 (spirotetramat) 、 螺 環 菌 胺
 (spiroxamine) 、 司 替 羅 磷 (stirofos) 、 鏈 黴 素
 (streptomycin) 、 番 木 鱉 鹼 (strychnine) 、 食 菌 甲 誘 醇

(sulcatol)、殺克隆(sulcofuron)、磺草酮(sulcotrione)、草克死(sulfallate)、氟磺唑草胺(sulfentrazone)、舒非侖(sulfiram)、氟蟲胺(sulfluramid)、磺噻隆(sulfodiazole)、嘧磺隆(sulfometuron)、草硫磷(sulfosate)、磺醯磺隆(sulfosulfuron)、治螟磷(sulfotep)、治螟磷(sulfotepp)、氟啶蟲胺腈(sulfoxaflor)、亞砒(sulfoxide)、硫脒磷(sulfoxime)、硫、硫酸、磺醯氟、蘇葡卡賓(sulglycapin)、草硫磷(sulphosate)、硫丙磷(sulprofos)、戊苯砒(sultropen)、滅草靈(swep)、τ-福化利(*tau*-fluvalinate)、稗草烯(tavron)、噻蟎威(tazimcarb)、TBTO、TBZ、TCA、TCBA、TCMTB、TCNB、TDE、得克利(tebuconazole)、得芬諾(tebufenozide)、得芬瑞(tebufenpyrad)、異丁乙氧喹啉(tebufloquin)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、牧草胺(tebutam)、得甫隆(tebuthiuron)、克枯爛(tecloftalam)、四氯硝基苯(tecnazene)、福美雙聯(tecoram)、三氯殺蟎砒(tedion)、得福隆(teflubenzuron)、汰福寧(tefluthrin)、特呋三酮(tefuryltrione)、環磺酮(tembotrione)、替美磷(temefos)、亞培松(temephos)、替哌(tepa)、TEPP、得殺草(tepraloxydim)、吡喃草酮(teproloxydim)、環戊烯丙菊酯(terallethrin)、特草定(terbacil)、特草靈(terbucarb)、特丁草胺(terbuchlor)、托福松(terbufos)、特丁通(terbumeton)、特丁津(terbuthylazine)、芽根靈(terbutol)、特丁淨(terbutryn)、

特丁淨(terbutryne)、五氯硝基苯(tetrachlor)、土黴素(terramycin)、土黴素(terramycin)、四環唑(tetacyclacis)、四氯乙烷(tetrachloroethane)、樂本松(tetrachlorvinphos)、四克利(tetraconazole)、得脫蟎(tetradifon)、殺蟎好(tetradisul)、四氟隆(tetrafluron)、治滅寧(tetramethrin)、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)、四胺、殺蟎黴素(tetranactin)、四普羅(tetraniliprole)、四氟丙酸鈉(tetrapion)、殺蟎硫醚(tetrasul)、硫酸鉍(thallium sulfate)、硫酸鉍(thalious sulfate)、欣克草(thenylchlor)、 θ -賽滅寧(cypermethrin)、腐絕(thiabendazole)、賽果培(thiacloprid)、噻二吡(thiadiazine)、噻噠氟(thiadifluor)、賽速安(thiamethoxam)、噻磺隆(thiameturon)、蟲腈(thiapronil)、噻氟隆(thiazafluron)、噻氟隆(thiazfluron)、噻唑(thiazone)、噻草啞(thiazopyr)、賽伏(thicrofos)、噻菌腈(thicyofen)、噻二唑草胺(thidiazimin)、噻苯隆(thidiazuron)、酮脲磺草吩酯(thiencarbazon)、噻吩磺隆(thifensulfuron)、賽氟滅(thifluzamide)、乙汞硫柳酸鈉(thimerosal)、甲拌磷(thimet)、殺丹(thiobencarb)、抗蟲威(thiocarboxime)、硫氯苯亞胺(thiochlorfenphim)、硫氯苯亞胺(thiochlorphenphime)、氰硫二硝基苯(thiocyanatodinitrobenzenes)、硫賜安(thiocyclam)、硫丹(thiodan)、噻菌-銅(thiodiazole-copper)、硫敵克

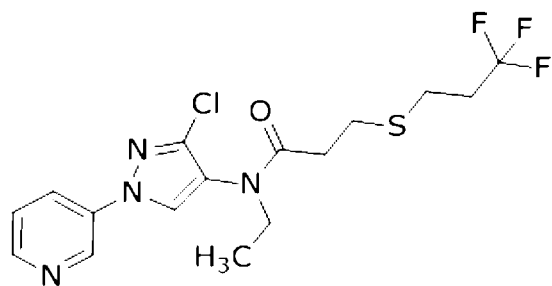
(thiodicarb) 、 久 效 威 (thiofanocarb) 、 硫 伐 隆 (thiofanox) 、 硫 氟 肟 (thiofluoximate) 、 不 育 硫 磷 (thiohempa) 、 硫 柳 汞 (thiomersal) 、 硫 滅 松 (thiometon) 、 治 線 磷 (thionazin) 、 多 保 淨 (thiophanate) 、 乙 基 多 保 淨 (thiophanate-ethyl) 、 甲 基 多 保 淨 (thiophanate-methyl) 、 對 硫 磷 (thiophos) 、 克 殺 蟎 (thioquinox) 、 胺 基 硫 脲 (thiosemicarbazide) 、 殺 蟲 雙 (thiosultap) 、 噻 替 派 (thiotepa) 、 殺 線 威 (thioxamyl) 、 得 恩 地 (thiram) 、 秋 蘭 姆 (thiuram) 、 蘇 力 菌 素 (thuringiensin) 、 噻 苯 達 唑 (tiabendazole) 、 噻 醯 菌 胺 (tiadinil) 、 氟 丙 嘧 草 酯 (tiafenacil) 、 調 劑 胺 (tiaojiean) 、 TIBA 、 噻 蟎 胺 (tifatol) 、 仲 草 丹 (tiocarbazil) 、 啼 草 胺 (tioclorim) 、 替 奧 沙 芬 (tioxazafen) 、 替 係 米 (tioxymid) 、 威 線 肟 (tirpate) 、 TMTD 、 脫 克 松 (tolclofos-methyl) 、 脫 芬 瑞 (tolfenpyrad) 、 托 普 洛 卡 (tolprocarb) 、 托 普 瑞 蕾 特 (tolpyralate) 、 對 甲 抑 菌 靈 (tolyfluanid) 、 甲 基 益 發 靈 (tolyfluanid) 、 甲 苯 基 乙 酸 汞 、 托 馬 蘭 (tomarin) 、 吡 草 磺 (topramezone) 、 德 克 沙 芬 (toxaphene) 、 TPN 、 三 甲 苯 草 酮 (tralkoxydim) 、 溴 氯 氰 菊 酯 (traloccythrin) 、 泰 滅 寧 (tralomethrin) 、 曲 洛 比 利 (tralopyril) 、 拜 富 寧 (transfluthrin) 、 反 式 百 滅 寧 (transpermethrin) 、 曲 他 胺 (tretamine) 、 三 十 烷 醇 (triacontanol) 、 三 泰 芬 (triadimefon) 、 三 泰 隆 (triadimenol) 、 氟 酮 磺 草 胺 (triafamone) 、 野 麥 畏 (triallate) 、 野 麥 畏 (tri-allate) 、 三

唑磷胺(triamiphos)、抑芽唑(triapenthenol)、三苯噻蟊
 吩(triarathene)、嘧菌醇(triarimol)、醚苯磺隆
 (triasulfuron)、唑蚜威(triazamate)、丁三唑(triazbutil)、
 三吡氟草胺(triaziflam)、三落松(triazophos)、乙基谷硫
 磷(triazothion)、唑菌吡(triazoxide)、鹼式氯化銅
 (tribasic copper chloride)、三元硫酸銅(tribasic copper
 sulfate)、苯磺隆(tribenuron)、脫葉磷(tribufos)、氧化
 三丁基錫、殺草畏(tricamba)、水楊菌胺(trichlamide)、
 三氯吡氧乙酸(trichlopyr)、三氯松(trichlorfon)、樂乃松
 (trichlormetaphos)-3、毒壤磷(trichloronat)、壤蟲磷
 (trichloronate)、三氯三硝基苯(trichlorotrinitrobenzenes)、敵
 百蟲(trichlorphon)、三氯比(triclopyr)、三環吡菌威
 (triclopyricarb)、三甲酚(tricresol)、三賽唑
 (tricyclazole)、三環己基氫氧化錫(tricyclohexyltin
 hydroxide)、三得芬(tridemorph)、滅草環(tridiphane)、
 草達津(trietazine)、蝸螺殺(trifenmorph)、三氯丙氧磷
 (trifenofos)、三氟敏(trifloxystrobin)、三氟啞磺隆
 (trifloxysulfuron)、三福戴嗎沙(trifludimoxazin)、三福
 滅作派林(triflumezopyrim)、賽福座(triflumizole)、三
 福隆(triflumuron)、三福林(trifluralin)、氟胺磺隆
 (triflusulfuron)、三氟苯氧丙酸(trifop)、三氟禾草肟
 (trifopsime)、賽福寧(triforine)、三羥基三吡、誘蠅羧酯
 (trimedlure)、混滅威(trimethacarb)、三甲隆
 (trimeturon)、抗倒酯(trinexapac)、三苯錫

(triphenyltin)、烯蟲硫酯(triprene)、三丙丹(tripropindan)、雷公藤甲素(triptolide)、草達克(tritac)、殺蟲釘(trithialan)、滅菌唑(triticonazole)、三氟甲磺隆(tritosulfuron)、特朗扣(trunc-call)、脫葉磷(tuoyelin)、單克素(uniconazole)、單克素(uniconazole)-P、福美甲腫(urbacide)、烏瑞替派(uredepa)、戊酸酯(valerate)、維利黴素(validamycin)、維利黴素A(validamycin A)、伐利芬奈蕾特(valifenalate)、異殺鼠酮(valone)、繁米松(vamidothion)、泛佳(vanguard)、凡力(vaniliprole)、萬隆(vernolate)、免克寧(vinclozolin)、維生素D3(vitamin D3)、華法林(warfarin)、硝蟲硫磷(xiaochongliulin)、辛菌胺(xinjunan)、烯肱菌胺(xiwojunan)、烯肱菌酯(xiwojunzhi)、XMC、二甲苯草胺(xylachlor)、二甲苯酚(xylenols)、滅爾蟲(xylylcarb)、噻蟎胺(xymiazole)、依希淨(yishijing)、氰菌胺(zarilamid)、玉米素(zeatin)、增效胺(zengxiaoan)、增效林(zengxiaolin)、ζ-賽滅寧(zeta-cypermethrin)、萘酸鋅、磷化鋅(zinc phosphide)、噻唑鋅(zinc thiazole)、噻唑鋅(zinc thiozole)、三氯酚鋅(zinc trichlorophenate)、三氯酚鋅(zinc trichlorophenoxide)、鋅乃浦(zineb)、福美鋅(ziram)、左拉伏(zolaprofos)、華法林鈉(zoocoumarin)、座賽胺(zoxamide)、唑胺菌酯(zuoanjunzhi)、唑草胺(zuocaoan)、唑菌酯(zuojunzhi)、唑嘧磺隆(zuomihuanglong)、α-氯醇(α-chlorohydrin)、α-蛻皮激

素(α -ecdysone)、 α -多紋素(α -multistriatin)、 α -萘乙酸(α -naphthaleneacetic acid)，及 β - 蛻皮激素(β -ecdysone)；

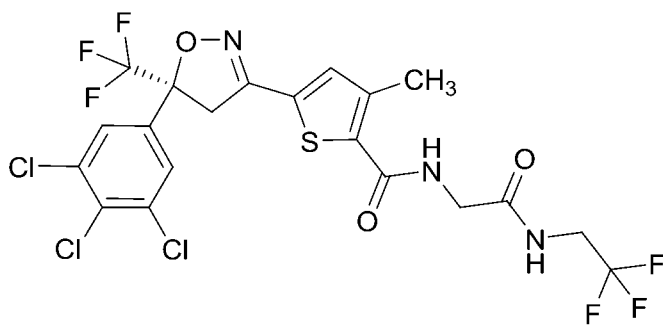
(2)下列分子



N-(3-氯-1-(吡啶-3-基)-1*H*-吡唑-4-基)-*N*-乙基-3-((3,3,3-三氟丙基)硫)丙醯胺

於此文件中，此分子為了便於使用，稱為“**AI-1**”；

(3) 一種被稱為羅提蘭(Lotilaner)的分子，其具有下列結構

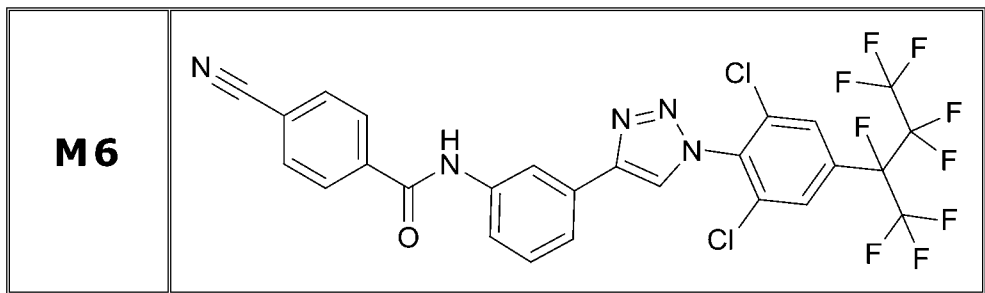


；以及

(4) 下列表A中的分子

表 A. M-活性成分的結構

名稱	結構
M1	$R = \text{CH}, \text{N}$ $R_1 = \text{H}, \text{Me}$
M2	$X = \text{F}, \text{Cl}$ $R = \text{H}, \text{F}$
M3	
M4	
M5	



【0015】如在本揭示中使用，上文各者為一種活性成分，以及二種或更多種為活性成分。關於更多資訊，請查閱位於Alanwood.net之“**COMPENDIUM OF PESTICIDE COMMON NAMES**”，及位於bcpdata.com.之“**THE PESTICIDE MANUAL**”之各種版本，包括在線版。

【0016】術語「烯基」意指由碳及氫組成之非環狀、不飽和(至少一個碳-碳雙鍵)、分支鏈或未分支的取代基，例如乙烯基、烯丙基、丁烯基、戊烯基及己烯基。

【0017】術語「烯氧基」係指進一步由碳-氧單鍵組成之烯基，如烯丙基氧基、丁烯氧基、戊烯氧基、己烯氧基。

【0018】術語「烷氧基」係指進一步由碳-氧單鍵組成之烷基，如甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、丁氧基、異丁氧基，以及三級丁氧基。

【0019】術語「烷基」係指由碳及氫組成之非環狀、飽和、分支鏈或未分支的取代基，例如甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基及三級丁基。

【0020】術語「炔基」意指由碳及氫組成之非環狀、不飽和(至少一個碳-碳參鍵)、分支鏈或未分支的取代基，例如乙炔基、炔丙基、丁炔基及戊炔基。

【0021】術語「炔氧基」意指進一步由碳-氧單鍵組成之炔基，例如戊炔氧基、己炔氧基、庚炔氧基及辛炔氧基。

【0022】術語「芳基」意指由氫及碳組成之環狀、芳香族取代基，例如苯基、萘基及聯苯。

【0023】術語「生物性殺蟲劑」意指一種微生物型生物性害蟲防治劑，一般而言，係以與化學性殺蟲劑類似的方式來施用。通常其等為細菌型，但亦有真菌控制劑之實例，包括木黴屬(*Trichoderma spp.*)及白粉寄生孢(*Ampelomyces quisqualis*)。一種眾所周知的生物性殺蟲劑實例為蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)，其係一種鱗翅目(Lepidoptera)、鞘翅目(Coleoptera)及雙翅目(Diptera)之細菌性疾病。生物性殺昆蟲劑包括以下列為基礎之產物：

(1) 昆蟲致病性真菌(如黑殭菌(*Metarhizium anisopliae*))；

(2) 昆蟲致病性線蟲(如蕪菁夜蛾斯氏線蟲(*Steinernema feltiae*))；以及

(3) 昆蟲致病性病毒(如蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella*)顆粒體病毒)。

【0024】昆蟲致病性生物體的其他實例包括但不限於桿狀病毒、原生動物及微孢子目(Microsporidia)。為了避免疑問，生物性殺蟲劑被認為是活性成分。

【0025】術語「環烯基」意指由碳與氫組成之單環或多環、不飽和(至少一碳-碳雙鍵)取代基，例如環丁烯基、環戊烯基、環己烯基、降莖烯、雙環[2.2.2]辛烯基、四氫

萘基、六氫萘基與八氫萘基。

【0026】術語「環烯氧基」係指更進一步由碳-氧單鍵組成之環烯基，例如環丁烯氧基、環戊烯氧基、降莰烯氧基，以及雙環[2.2.2]辛烯氧基。

【0027】術語「環烷基」係指由碳與氫組成之單環或多環、飽和取代基，例如環丙基、環丁基、環戊基、降莰烯、雙環[2.2.2]辛基與十氫萘。

【0028】術語「環烷氧基」係指更進一步由碳-氧單鍵組成之環烷基，如環丙氧基、環丁氧基、環戊氧基、降莰烯氧基與雙環[2.2.2]辛基氧基。

【0029】術語「鹵基」係指氟、氯、溴與碘。

【0030】術語「鹵烷氧基」係指進一步由一至最大可能數目之相同或相異之鹵素組成之烷氧基，如氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2-二氟丙氧基、氯甲氧基、三氯甲氧基、1,1,2,2-四氟乙氧基與五氟乙氧基。

【0031】術語「鹵烷基」係指進一步由一至最大可能數目、相同或相異之鹵素組成之烷基，如氟甲基、三氟甲基、2,2-二氟丙基、氯甲基、三氯甲基與1,1,2,2-三氟乙基。

【0032】術語「雜環基」意指可能為芳香族、完全飽和，或部分或完全不飽和的環狀取代基，其中該環狀結構含有至少一個碳及至少一個雜原子，其中該雜原子為氮、硫或氧。實例為：

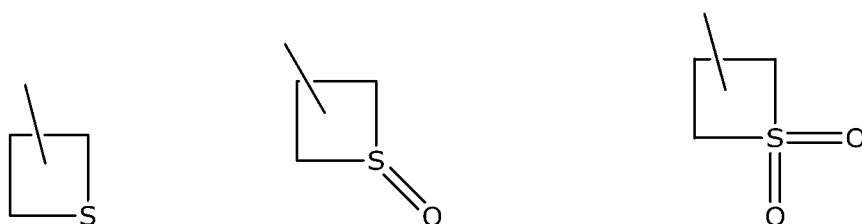
(1)芳香性雜環基取代基包括，但不限於苯并呋喃基、苯并異噻唑基、苯并異噁唑基、苯并噁唑基、苯并噻吩基、

苯并噻唑基吡啶基(cinnolinyl)、呋喃基、𠄎唑基、𠄎噪基、咪唑基、異𠄎噪基、異喹啉基、異噻唑基、異𦍇唑基、𦍇二唑基、𦍇唑啉基、𦍇唑基、𧀵𧀾基、𧀵𧀼基、𧀵唑啉基、𧀵唑基、嗒𧀾基、𧀸𧀺基、𧀸𧀽基、𧀸咯基、喹唑啉基、喹啉基、喹𨮐啉基、四唑基、噻唑啉基、噻唑基、噻吩基、三𧀾基及三𧀼基；

(2)完全飽和之雜環基取代基包括，但不限於：六氫吡
 咭基、哌啶基、嗎啉基、吡咯啶基、四氫呋喃基，及四氫
 哌喃基；

(3)部分或完全不飽和的雜環基取代基包括，但不限於1,2,3,4-四氫-喹啉基、4,5-二氫-嘮唑基、4,5-二氫-1*H*-吡唑基、4,5-二氫-異嘮唑基以及2,3-二氫-[1,3,4]-嘮二唑基；以及

(4)額外的雜環基實例包括以下各者：



硫化三亞甲基 硫化三亞甲基-氧化物及硫化三亞甲基-二氧化物。

【0033】術語「所在地」意指一棲息地、養育場、植物、種子、土壤、材料，或害蟲將生長、能生長或能走過之環境，舉例而言，所在地可為：生長中之農作物、樹木、水果、穀物、飼料種類、葡萄、草皮，及/或觀賞植物之處；圈養動物居住之處；建築之內部或外部表面(如儲存穀物之處)；建築內所使用之建構材料(如浸漬木材)；以及建築附

近之土壤。

【0034】用語「**MoA**材料」意指一種材料，其具有如同位於 irac-online.org，IRAC MoA Classification v. 7.3中所示的作用模式(「**MoA**」)，描述以下幾組：

- (1)乙醯膽鹼酯酶(AChE)抑制劑；
- (2)GABA-閘控型氯離子通道拮抗劑；
- (3)鈉離子通道調節劑；
- (4)菸鹼型乙醯膽鹼(nAChR)協同劑；
- (5)菸鹼型乙醯膽鹼受器(nAChR)別構活化物；
- (6)氯離子通道活化劑；
- (7)保幼激素模擬物；
- (8)雜類非特異性(多重位置)抑制劑；
- (9)弦音器官(Chordotonal Organs)調節劑；
- (10)蠕生長抑制劑；
- (11)破壞昆蟲中腸膜之微生物；
- (12)粒腺體ATP合成酶抑制劑；
- (13)經由破壞質子梯度之氧化性磷酸化非耦聯劑；
- (14)菸鹼型乙醯膽鹼受器(nAChR)通道阻斷劑；
- (15)幾丁質生合成抑制劑，第0型；
- (16)幾丁質生合成抑制劑，第1型；
- (17)雙翅目脫皮干擾劑；
- (18)蛻皮激素受器協同劑；
- (19)章魚胺受器協同劑；
- (20)粒腺體複合物III電子傳遞抑制劑；

- (21)粒腺體複合物I電子傳遞抑制劑；
- (22)電壓-依賴型鈉離子通道阻斷劑；
- (23)乙醯基輔酶A羧化酶抑制劑；
- (24)粒腺體複合物IV電子傳遞抑制劑；
- (25)粒腺體複合物II電子傳遞抑制劑；以及
- (28)羅納丹受器(Ryanodine receptor)調節劑。

【0035】用語「**MoA**材料群組 α 」(此後稱為“**MoAMGA**”)係集體意指下列材料：阿巴美丁(abamectin)、毆殺松(acephate)、亞醯蟎(acequinocyl)、亞滅培(acetamiprid)、阿納寧(acrinathrin)、棉鈴威(alanycarb)、得滅克(aldicarb)、亞列寧(allethrin)、 α -賽滅寧(***alpha***-cypermethrin)、磷化鋁(aluminium phosphide)、三亞蟎(amitraz)、亞滅松(azamethiphos)、乙基谷速松(azinphos-ethyl)、谷速松(azinphos-methyl)、亞環錫(azocyclotin)、免敵克(bendiocarb)、免扶克(benfuracarb)、免速達(bensultap)、 β -賽扶寧(***beta***-cyfluthrin)、 β -賽滅寧(***beta***-cypermethrin)、畢芬寧(bifenthrin)、百亞列寧(bioallethrin)、S-環戊烯基百亞列寧異構物(bioallethrin S-cyclopentenyl isomer)、生物苜呋菊酯(bioresmethrin)、雙三氟蟲脲(bistrifluron)、硼砂、布芬淨(buprofezin)、佈嘉信(butocarboxim)、丁酮砒威(butoxycarboxim)、硫線磷(cadusafos)、磷化鈣、胺甲(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、丁基加保扶

(carbosulfan)、培丹鹽酸鹽(cartap hydrochloride)、剋安勃(chlorantraniliprole)、可氯丹(chlordane)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、克凡派(chlorfenapyr)、氯芬松(chlorfenvinphos)、克福隆(chlorfluazuron)、氯甲磷(chlormephos)、氯化苦(chloropicrin)、陶斯松(chlorpyrifos)、甲基陶斯松(chlorpyrifos-methyl)、可芬諾(chromafenozide)、克芬蟎(clofentezine)、可尼丁(clothianidin)、蠅毒磷(coumaphos)、氰化物、氰乃松(cyanophos)、氰蟲醯胺(cyantraniliprole)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、啞蟎氰(cyenopyrafen)、賽芬蟎(cyflumetofen)、賽扶寧(cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、錫蟎丹(cyhexatin)、賽滅寧(cypermethrin)、賽芬寧(cyphenothrin)、賽滅淨(cyromazine)、右旋順式反式氯丙炔菊酯(*d-cis-trans*-allethrin)、DDT、第滅寧(deltamethrin)、甲基內吸磷-S、汰芬隆(diafenthiuron)、大利松(diazinon)、二氯松(dichlorvos)/DDVP、雙特松(dicrotophos)、氟蟎吡(diflovidazin)、福隆(diflubenzuron)、大滅松(dimethoate)、二甲基亞硝胺(dimethylvinphos)、達特南(dinotefuran)、二硫松(disulfoton)、DNOC、右旋反式氯丙炔菊酯(*d-trans*-allethrin)、因滅汀苯甲酸鹽(emamectin benzoate)、益避寧(empenthrin)、安殺番(endosulfan)、EPN、益化利(esfenvalerate)、愛芬克(ethiofencarb)、愛

殺松 (ethion) 、 普 伏 松 (ethoprophos) 、 依 芬 寧 (etofenprox) 、 依 殺 蟎 (etoxazole) 、 胺 磺 磷 (famphur) 、 芬 滅 松 (fenamiphos) 、 芬 殺 蟎 (fenazaquin) 、 芬 佈 賜 (fenbutatin oxide) 、 撲 滅 松 (fenitrothion) 、 丁 基 滅 必 蝨 (fenobucarb) 、 芬 諾 克 (fenoxycarb) 、 芬 普 寧 (fenpropathrin) 、 芬 普 蟎 (fenpyroximate) 、 芬 殺 松 (fenthion) 、 芬 化 利 (fenvalerate) 、 氟 尼 胺 (flonicamid) 、 啞 蟎 酯 (fluacrypyrim) 、 氟 大 滅 (flubendiamide) 、 氟 蟎 脲 (flucycloxuron) 、 護 賽 寧 (flucythrinate) 、 氟 芬 隆 (flufenoxuron) 、 氟 氯 苯 菊 酯 (flumethrin) 、 弗 比 南 載 夫 隆 (flupyradifurone) 、 覆 滅 蟎 (formetanate) 、 福 賽 絕 (fosthiazate) 、 呋 線 威 (furathiocarb) 、 γ - 賽 洛 寧 (*gamma*-cyhalothrin) 、 合 芬 寧 (halfenprox) 、 合 芬 隆 (halofenozide) 、 飛 達 松 (heptenophos) 、 六 伏 隆 (hexaflumuron) 、 合 賽 多 (hexythiazox) 、 愛 美 隆 (hydramethylnon) 、 烯 蟲 乙 酯 (hydroprene) 、 新 煙 鹼 類 (imicyafos) 、 益 達 胺 (imidacloprid) 、 依 普 寧 (imiprothrin) 、 因 得 克 (indoxacarb) 、 亞 芬 松 (isofenphos) 、 滅 必 蝨 (isoprocarb) 、 加 福 松 (isoxathion) 、 噠 噠 菊 酯 (kadethrin) 、 烯 蟲 炔 酯 (kinoprene) 、 λ - 賽 洛 寧 (*lambda*-cyhalothrin) 、 里 琵 菌 素 (lepimectin) 、 祿 芬 隆 (lufenuron) 、 馬 拉 松 (malathion) 、 滅 加 松 (mecarbam) 、 美 氟 綜 (metaflumizone) 、 達 馬 松 (methamidophos) 、 滅 大 松 (methidathion) 、 滅 賜 克 (methiocarb) 、 納 乃 得

(methomyl)、美賜平(methoprene)、(甲氧基胺基硫基-磷
 醯基)水楊酸酯、甲氧滴滴涕(methoxychlor)、滅芬諾
 (methoxyfenozide)、溴甲烷、治滅蝨(metolcarb)、美文
 松(mevinphos)、密滅汀(milbemectin)、亞素靈
 (monocrotophos)、乃力松(naled)、尼古丁、烯啶蟲胺
 (nitenpyram)、諾伐隆(novaluron)、多氟脲
 (noviflumuron)、歐殺滅(oxamyl)、滅多松
 (oxydemeton-methyl)、巴拉松(parathion)、甲基巴拉松、
 百滅寧(permethrin)、酚丁滅寧(phenothrin)、賽達松
 (phenthoate)、福瑞松(phorate)、裕必松(phosalone)、益
 滅松(phosmet)、福賜米松(phosphamidon)、磷、巴賽松
 (phoxim)、比加普(pirimicarb)、亞特松
 (pirimiphos-methyl)、普亞烈寧(prallethrin)、佈飛松
 (profenofos)、毆蟎多(propargite)、撲達松
 (propetamphos)、安丹(propoxur)、普硫松(prothiofos)、
 派滅淨(pymetrozine)、白克松(pyraclofos)、除蟲菊精、
 畢達本(pyridaben)、必芬松(pyridaphenthion)、畢汰芬
 (pyrimidifen)、百利普芬(pyriproxyfen)、拜裕松
 (quinalphos)、列滅寧(resmethrin)、魚藤酮(rotenone)、
 矽護芬(silafluofen)、賜諾特(spinetoram)、賜諾殺
 (spinosad)、賜派芬(spirodiclofen)、螺甲蟎酯
 (spiromesifen)、螺蟲乙酯(spirotetramat)、氟蟲胺
 (sulfluramid)、治螟磷(sulfotep)、氟啶蟲胺腈
 (sulfoxaflor)、磺醯氟、吐酒石、T-福化利

(***tau***-fluvalinate)、得芬諾(tebufenozide)、得芬瑞(tebufenpyrad)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、得福隆(teflubenzuron)、汰福寧(tefluthrin)、亞培松(temephos)、托福松(terbufos)、樂本松(tetrachlorvinphos)、得脫蟎(tetradifon)、治滅寧(tetramethrin)、治滅寧(tetramethrin)、 θ -賽滅寧(***theta***-cypermethrin)、賽果培(thiacloprid)、賽速安(thiamethoxam)、硫賜安(thiocyclam)、硫敵克(thiodicarb)、硫伐隆(thiofanox)、硫滅松(thiometon)、殺蟲雙鈉(thiosultap-sodium)、脫芬瑞(tolfenpyrad)、泰滅寧(tralomethrin)、拜富寧(transfluthrin)、啞蚜威(triazamate)、三落松(triazophos)、三氯松(trichlorfon)、三福隆(triflumuron)、混滅威(trimethacarb)、繁米松(vamidotion)、XMC、滅爾蝨(xylylcarb)、 ζ -賽滅寧(***zeta***-cypermethrin)，及磷化鋅(zinc phosphide)。為了避免疑問，前述材料各者為一種活性成分。

【0036】術語「害蟲」係意指一種生物體，其對人類或是人類關心的事物(譬如，作物、食物、家畜等等)是有害的，該生物體係來自於節肢動物門、軟體動物門，或圓形動物門，特定的實例為螞蟻、蚜蟲、甲蟲、蠹蟲(bristletails)、蟑螂、蟋蟀、蠼螋(earwigs)、跳蚤、蒼蠅、蚱蜢、葉蟬、蝨(包括海蝨)、蝗蟲、蟎、蛾、線蟲(nematode)、介殼蟲、綜合綱(symphylans)、白蟻、薊馬(thrips)、壁蝨、胡蜂，以及粉虱。額外的實例為下列之害蟲：

(1) 螯肢動物亞門(**Subphyla Chelicerata**)、多足亞門(**Myriapoda**)、甲殼綱(**Crustacea**)，及六足亞門(**Hexapoda**)；

(2) 蛛形綱(**Arachnida**)、顎足綱(**Maxillopoda**)、綜合綱(**Symphyla**)，及昆蟲綱(**Insecta**)；

(3) 虱目(**Order Anoplura**)。特定屬之非窮舉性清單包括，但不限於，血虱屬(*Haematopinus* spp.)、甲脅虱屬(*Hoplopleura* spp.)、顎虱屬(*Linognathus* spp.)、虱屬(*Pediculus* spp.)及鱗虱屬(*Polyplax* spp.)。特定物種之非窮舉性清單包括，但不限於，驢血虱(*Haematopinus asini*)、豬血虱(*Haematopinus suis*)、毛虱(*Linognathus setosus*)、綿羊顎虱(*Linognathus ovillus*)、人頭蝨(*Pediculus humanus capitis*)、人體虱(*Pediculus humanus humanus*)及陰虱(*Phthirus pubis*)。

(4) 鞘翅目(**Order Coleoptera**)。特定屬之非窮舉性清單包括但不限於，豆象屬(*Acanthoscelides* spp.)、叩頭蟲屬(*Agriotes* spp.)、花象屬(*Anthonomus* spp.)、梨象屬(*Apion* spp.)、金龜屬(*Apogonia* spp.)、守瓜屬(*Aulacophora* spp.)、豆象蟲屬(*Bruchus* spp.)、天牛屬(*Cerosterna* spp.)、豆葉甲蟲屬(*Cerotoma* spp.)、龜象屬(*Ceutorhynchus* spp.)、跳甲屬(*Chaetocnema* spp.)、肖葉甲蟲屬(*Colaspis* spp.)、金針蟲屬(*Ctenicera* spp.)、象鼻蟲屬(*Curculio* spp.)、圓頭犀金龜屬(*Cyclocephala* spp.)、葉甲屬(*Diabrotica* spp.)、葉象屬(*Hypera* spp.)、

齒小蠹屬(*Ips* spp.)、粉蠹屬(*Lyctus* spp.)、美洲葉甲屬(*Megascelis* spp.)、露尾甲屬(*Meligethes* spp.)、耳象屬屬(*Otiorhynchus* spp.)、短喙象屬(*Pantomorus* spp.)、鰓角金龜屬(*Phyllophaga* spp.)、菜葉蚤屬(*Phyllotreta* spp.)、根觸金龜屬(*Rhizotrogus* spp.)、虎象屬(*Rhynchites* spp.)、大象鼻蟲屬(*Rhynchophorus* spp.)、小蠹屬(*Scolytus* spp.)、禾象鼻蟲屬(*Sphenophorus* spp.)、米象屬(*Sitophilus* spp.)，以及擬穀盜屬(*Tribolium* spp.)。特定物種之非窮舉性清單包括但不限於，菜豆象(*Acanthoscelides obtectus*)、白蠟窄吉丁(*Agrilus planipennis*)、光肩星天牛(*Anoplophora glabripennis*)、棉鈴象蟲(*Anthonomus grandis*)、黑絨金龜(*Ataenius spretulus*)、甜菜隱食甲蟲(*Atomaria linearis*)、甜菜象(*Bothynoderes punctiventris*)、豌豆象(*Bruchus pisorum*)、四紋豆象(*Callosobruchus maculatus*)、黃斑露尾甲(*Carpophilus hemipterus*)、甜菜龜甲(*Cassida vittata*)、豆葉甲(*Cerotoma trifurcata*)、白菜籽龜象(*Ceutorhynchus assimilis*)、茺菁龜象(*Ceutorhynchus napi*)、梯斑叩頭蟲(*Conoderus scalaris*)、多斑叩頭蟲(*Conoderus stigmosus*)、李象鼻蟲(*Conotrachelus nenuphar*)、綠花金龜(*Cotinis nitida*)、天門冬金花蟲(*Crioceris asparagi*)、鏽赤扁穀盜(*Cryptolestes ferrugineus*)、長角扁穀盜(*Cryptolestes pusillus*)、土耳其扁穀盜(*Cryptolestes turcicus*)、密點細枝象蟲

(*Cylindrocopturus adpersus*)、芒果切葉象甲(*Deporaus marginatus*)、火腿皮蠹(*Dermestes lardarius*)、白腹皮蠹(*Dermestes maculatus*)、墨西哥豆瓢蟲(*Epilachna varivestis*)、蛀莖象甲(*Faustinus cubae*)、蒼白根頸象(*Hylobius pales*)、紫苜蓿葉象(*Hypera postica*)、咖啡果小蠹(*Hypothenemus hampei*)、菸草甲(*Lasioderma serricorne*)、馬鈴薯甲蟲(*Leptinotarsa decemlineata*)、麗金龜(*Liogenys fuscus*)、條紋水象甲(*Liogenys suturalis*)、水稻水象鼻蟲(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、*Maecolaspis joliveti*、玉米叩甲(*Melanotus communis*)、油菜露尾甲(*Meligethes aeneus*)、大栗鰓角金龜子(*Melolontha melolontha*)、梯頂天牛(*Oberea brevis*)、線形筒天牛(*Oberea linearis*)、椰子犀角金龜(*Oryctes rhinoceros*)、貿易穀盜扁蟲(*Oryzaephilus mercator*)、鋸穀盜(*Oryzaephilus surinamensis*)、黑角負泥蟲(*Oulema melanopus*)、水稻負泥蟲(*Oulema oryzae*)、金龜子(*Phyllophaga cuyabana*)、日本麗金龜(*Popillia japonica*)、大穀蠹(*Prostephanus truncatus*)、穀蠹(*Rhyzopertha dominica*)、條紋根瘤象甲(*Sitona lineatus*)、穀象(*Sitophilus granarius*)、米象(*Sitophilus oryzae*)、玉米象(*Sitophilus zeamais*)、藥材甲(*Stegobium paniceum*)、大穀盜(*Tenebroides mauritanicus*)、擬穀盜(*Tribolium castaneum*)、雜擬穀盜(*Tribolium confusum*)、花斑皮蠹(*Trogoderma variabile*)，及玉米

距步甲蟲(*Zabrus tenebrioides*)。

(5)革翅目(**Order Dermaptera**)。特定屬之非窮舉性清單包括但不限於，普通蠹蝨(*Forficula auricularia*)。

(6)蜚蠊目(**Order Blattaria**)。特定物種之非窮舉性清單包括但不限於，德國姬蠊(*Blattella germanica*)、東方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、賓西法尼亞木蠊(*Parcoblatta pennsylvanica*)、美洲家蠊(*Periplaneta americana*)、澳洲家蠊(*Periplaneta australasiae*)、棕色家蠊(*Periplaneta brunnea*)、黑褐家蠊(*Periplaneta fuliginosa*)、蔗綠蜚蠊(*Pycnoscelus surinamensis*)及長鬚帶蠊(*Supella longipalpa*)。

(7)雙翅目(**Order Diptera**)。特定屬之非窮舉性清單包括但不限於，斑蚊屬(*Aedes* spp.)、潛蠅屬(*Agromyza* spp.)、按實蠅屬(*Anastrepha* spp.)、瘧蚊屬(*Anopheles* spp.)、果實蠅屬(*Bactrocera* spp.)、地中海實蠅屬(*Ceratitis* spp.)、斑虻屬(*Chrysops* spp.)、錐蠅屬(*Cochliomyia* spp.)、瘿蚊屬(*Contarinia* spp.)、家蚊屬(*Culex* spp.)、葉瘿蚊屬(*Dasineura* spp.)、艷粉蝶屬(*Delia* spp.)、果蠅屬(*Drosophila* spp.)、廁蠅屬(*Fannia* spp.)、黑蠅屬(*Hylemyia* spp.)、斑潛蠅屬(*Liriomyza* spp.)、家蠅屬(*Musca* spp.)、草種蠅屬(*Phorbia* spp.)、虻屬(*Tabanus* spp.)及大蚊屬(*Tipula* spp.)。特定物種之非窮舉性清單包括但不限於，紫苜蓿潛蠅(*Agromyza frontella*)、加勒比按實蠅(*Anastrepha suspensa*)、墨西

哥果實蠅 (*Anastrepha ludens*)、西印度果實蠅 (*Anastrepha obliqua*)、瓜實蠅(*Bactrocera cucurbitae*)、東方果實蠅(*Bactrocera dorsalis*)、入侵實蠅(*Bactrocera invadens*)、桃實蠅(*Bactrocera zonata*)、地中海實蠅 (*Ceratitis capitata*)、油菜葉癭蚊 (*Dasineura brassicae*)、灰地種蠅(*Delia platura*)、黃腹廁蠅(*Fannia canicularis*)、灰腹廁蠅 (*Fannia scalaris*)、腸胃蠅 (*Gasterophilus intestinalis*)、*Gracillia perseae*、東方臂蠅 (*Haematobia irritans*)、紋皮蠅 (*Hypoderma lineatum*)、菜斑潛蠅(*Liriomyza brassicae*)、綿羊虱蠅 (*Melophagus ovinus*)、秋家蠅(*Musca autumnalis*)、普通家蠅(*Musca domestica*)、羊狂蠅(*Oestrus ovis*)、黑麥稈蠅(*Oscinella frit*)、甜菜泉蠅(*Pegomya betae*)、胡蘿蔔蠅(*Psila rosae*)、櫻桃果實蠅(*Rhagoletis cerasi*)、蘋果果實蠅 (*Rhagoletis pomonella*)、藍橘繞實蠅 (*Rhagoletis mendax*)、麥紅吸漿蟲 (*Sitodiplosis mosellana*)及廐螯蠅(*Stomoxys calcitrans*)。

(8)半翅目(Order Hemiptera)。特定屬之非窮舉性清單包括但不限於，球蚜屬(*Adelges* spp.)、輪盾介殼蟲屬 (*Aulacaspis* spp.)、沫蟬屬(*Aphrophora* spp.)、蚜蟲屬 (*Aphis* spp.)、粉虱屬(*Bemisia* spp.)、蠟蚧屬(*Ceroplastes* spp.)、雪盾介殼蟲屬(*Chionaspis* spp.)、褐圓盾介殼蟲屬 (*Chrysomphalus* spp.)、介殼蟲屬(*Coccus* spp.)、小綠葉蟬屬 (*Empoasca* spp.)、蠣盾介殼蟲屬 (*Lepidosaphes*

spp.)、稻椿象屬(*Lagynotomus* spp.)、草盲蝽屬(*Lygus* spp.)、長管蚜屬(*Macrosiphum* spp.)、黑尾葉蟬屬(*Nephotettix* spp.)、稻綠蝽屬(*Nezara* spp.)、沫蟬屬(*Philaenus* spp.)、植盲蝽屬(*Phytocoris* spp.)、壁蝽屬(*Piezodorus* spp.)、臀紋粉介殼蟲屬(*Planococcus* spp.)、粉介殼蟲屬(*Pseudococcus* spp.)、縊管蚜屬(*Rhopalosiphum* spp.)、黑盔蚧屬(*Saissetia* spp.)、彩斑蚜屬(*Therioaphis* spp.)、蠟蚧蟲屬(*Toumeyella* spp.)、桔蚜屬(*Toxoptera* spp.)、粉虱屬(*Trialeurodes* spp.)、錐蝽屬(*Triatoma* spp.)及矢盾介殼蟲屬(*Unaspis* spp.)。特定物種之非窮舉性清單包括但不限於，擬綠蝽(*Acrosternum hilare*)、豌豆蚜(*Acyrtosiphon pisum*)、甘藍粉虱(*Aleyrodes proletella*)、螺旋粉虱(*Aleurodicus dispersus*)、絲絨粉虱(*Aleurothrixus floccosus*)、二點小綠葉蟬(*Amrasca biguttula biguttula*)、紅圓蚧(*Aonidiella aurantii*)、棉蚜(*Aphis gossypii*)、大豆蚜(*Aphis glycines*)、蘋果蚜(*Aphis pomi*)、馬鈴薯蚜(*Aulacorthum solani*)、銀葉粉虱(*Bemisia argentifolii*)、煙草粉虱(*Bemisia tabaci*)、麥長蝽(*Blissus leucopterus*)、天門冬小管蚜(*Brachycorynella asparagi*)、稻粉介殼蟲(*Brevennia rehi*)、甘藍蚜(*Brevicoryne brassicae*)、馬鈴薯俊盲蝽(*Calocoris norvegicus*)、紅蠟介殼蟲(*Ceroplastes rubens*)、熱帶臭蟲(*Cimex hemipterus*)、溫帶臭蟲(*Cimex lectularius*)、

Dagbertus fasciatus、*Dichelops furcatus*、麥雙尾蚜 (*Diuraphis noxia*)、柑橘木虱(*Diaphorina citri*)、車前圓尾蚜(*Dysaphis plantaginea*)、棉黑翅紅蝽(*Dysdercus suturellus*)、*Edessa meditabunda*、蘋果綿蚜(*Eriosoma lanigerum*)、歐扁盾蝽(*Eurygaster maura*)、英雄美洲蝽(*Euschistus heros*)、褐美洲蝽(*Euschistus servus*)、安氏角盲蝽(*Helopeltis antonii*)、茶角盲蝽(*Helopeltis theivora*)、吹棉介殼蟲(*Icerya purchasi*)、檬果褐葉蟬(*Idioscopus nitidulus*)、斑飛虱(*Laodelphax striatellus*)、大稻緣蝽(*Leptocorisa oratorius*)、稻緣椿象(*Leptocorisa varicornis*)、豆莢草盲蝽(*Lygus hesperus*)、桑粉介殼蟲(*Maconellicoccus hirsutus*)、大戟長管蚜(*Macrosiphum euphorbiae*)、麥長管蚜(*Macrosiphum granarium*)、薔薇長管蚜(*Macrosiphum rosae*)、翠菊葉蟬(*Macrosteles quadrilineatus*)、沫蟬(*Mahanarva frimbiolata*)、麥無網蚜(*Metopolophium dirhodum*)、長角椿象(*Mictis longicornis*)、桃蚜(*Myzus persicae*)、偽黑尾葉蟬(*Nephotettix cinctipes*)、*Neurocolpus longirostris*、稻綠蝽(*Nezara viridula*)、褐飛蝨(*Nilaparvata lugens*)、糠片盾蚧(*Parlatoria pergandii*)、黑片盾介殼蟲(*Parlatoria ziziphi*)、玉米花翅飛虱(*Peregrinus maidis*)、葡萄根瘤蚜(*Phylloxera vitifoliae*)、去杉球蚧(*Physokermes piceae*)、加州盲蝽(*Phytocoris californicus*)、植盲蝽(*Phytocoris*

relativus)、蓋德擬壁蝨(*Piezodorus guildinii*)、四線盲蝨(*Poecilocapsus lineatus*)、盲蝨(*Psallus vaccinicola*)、酪梨椿象(*Pseudacysta perseae*)、菠蘿潔粉介殼蟲(*Pseudococcus brevipes*)、梨園盾蚧(*Quadraspidiotus perniciosus*)、玉米蚜(*Rhopalosiphum maidis*)、稻麥蚜(*Rhopalosiphum padi*)、欖珠蠟蚧(*Saissetia oleae*)、栗花椿象(*Scaptocoris castanea*)、麥二叉蚜(*Schizaphis graminum*)、麥長管蚜(*Sitobion avenae*)、白背飛虱(*Sogatella furcifera*)、溫室粉虱(*Trialeurodes vaporariorum*)、結翅粉蝨(*Trialeurodes abutiloneus*)、箭頭介殼蟲(*Unaspis yanonensis*)以及 *Zulia entrerriana*。

(9)膜翅目(Order Hymenoptera)。特定屬之非窮舉性清單包括但不限於，切葉蟻屬(*Acromyrmex* spp.)、葉蟻屬(*Atta* spp.)、巨山蟻屬(*Camponotus* spp.)、松葉蜂屬(*Diprion* spp.)、蟻屬(*Formica* spp.)、單家蟻屬(*Monomorium* spp.)、新松葉蜂屬(*Neodiprion* spp.)、收穫蟻屬(*Pogonomyrmex* spp.)、馬蜂屬(*Polistes* spp.)、紅火蟻屬(*Solenopsis* spp.)、黃胡蜂屬(*Vespula* spp.)，及絨木蜂屬(*Xylocopa* spp.)。特定物種之非窮舉性清單包括但不限於，紅角菜葉蜂(*Athalia rosae*)、德克塞斯切葉蟻(*Atta texana*)、阿根廷虹琉璃蟻(*Iridomyrmex humilis*)、小黑蟻(*Monomorium minimum*)、小黃單家蟻(*Monomorium pharaonis*)、入侵紅火蟻(*Solenopsis*

invicta)、熱帶火蟻(*Solenopsis geminata*)、偷竊蟻(*Solenopsis molesta*)、黑火蟻(*Solenopsis richteri*)、南方火蟻(*Solenopsis xyloni*)，及酸臭家蟻(*Tapinoma sessile*)。

(10)等翅目(Order Isoptera)。特定屬之非窮舉性清單包括但不限於，乳白蟻屬(*Coptotermes* spp.)、角象白蟻屬(*Cornitermes* spp.)、堆砂白蟻屬(*Cryptotermes* spp.)、異白蟻屬(*Heterotermes* spp.)、木白蟻屬(*Kalotermes* spp.)、楹白蟻屬(*Incisitermes* spp.)、大白蟻屬(*Macrotermes* spp.)、緣木白蟻屬(*Marginitermes* spp.)、鋸白蟻屬(*Microcerotermes* spp.)、原角白蟻屬(*Procornitermes* spp.)、散白蟻屬(*Reticulitermes* spp.)、長鼻白蟻屬(*Schedorhinotermes* spp.)及古白蟻屬(*Zootermopsis* spp.)。特定物種之非窮舉性清單包括但不限於，曲顎乳白蟻(*Coptotermes curvignathus*)、法國乳白蟻(*Coptotermes frenchii*)、臺灣乳白蟻(*Coptotermes formosanus*)、金黃異白蟻(*Heterotermes aureus*)、稻麥小白蟻(*Microtermes obesi*)、班努斯散白蟻(*Reticulitermes banyulensis*)、草地散白蟻(*Reticulitermes grassei*)、黃肢散白蟻(*Reticulitermes flavipes*)、哈氏散白蟻(*Reticulitermes hageni*)、西方散白蟻(*Reticulitermes hesperus*)、桑特散白蟻(*Reticulitermes santonensis*)、黃胸散白蟻(*Reticulitermes speratus*)、美黑脛散白蟻

(*Reticulitermes tibialis*) 及 美 小 黑 散 白 蟻 (*Reticulitermes virginicus*)。

(11)鱗翅目(**Order Lepidoptera**)。特定屬之非窮舉性清單包括但不限於，捲葉蛾屬(*Adoxophyes* spp.)、地老虎屬(*Agrotis* spp.)、帶卷蛾屬(*Argyrotaenia* spp.)、卷葉蛾屬(*Cacoecia* spp.)、麗細蛾屬(*Caloptilia* spp.)、水稻螟蟲屬(*Chilo* spp.)、鏤紋夜蛾屬(*Chrysodeixis* spp.)、豆粉蝶屬(*Colias* spp.)、草螟屬(*Crambus* spp.)、絹野螟屬(*Diaphania* spp.)、螟屬(*Diatraea* spp.)、鑽夜蛾屬(*Earias* spp.)、粉斑螟屬(*Ephestia* spp.)、尺蠖蛾屬(*Epimecis* spp.)、斑點夜蛾屬(*Feltia* spp.)、角劍夜蛾屬(*Gortyna* spp.)、鈴夜蛾屬(*Helicoverpa* spp.)、實夜蛾屬(*Heliothis* spp.)、根蠹屬(*Indarbela* spp.)、潛夜細蛾屬(*Lithocolletis* spp.)、切根蟲屬(*Loxagrotis* spp.)、天幕毛蟲屬(*Malacosoma* spp.)、疆夜蛾屬(*Peridroma* spp.)、小潛細蛾屬(*Phyllonorycter* spp.)、黏夜蛾屬(*Pseudaletia* spp.)、蛀莖夜蛾屬(*Sesamia* spp.)、夜盜蛾屬(*Spodoptera* spp.)、透翅蛾屬(*Synanthedon* spp.)及巢蛾屬(*Yponomeuta* spp.)。特定物種之非窮舉性清單包括但不限於，飛揚阿夜蛾(*Achaea janata*)、棉褐帶卷蛾(*Adoxophyes orana*)、小地老虎(*Agrotis ipsilon*)、棉葉波紋夜蛾(*Alabama argillacea*)、鱷梨卷葉蟲(*Amorbia cuneana*)、臍橙螟(*Amyelois transitella*)、棕灰蛾(*Anacamptodes defectaria*)、桃杓蛾(*Anarsia*

lineatella)、黃麻夜蛾(*Anomis sabulifera*)、梨豆夜蛾(*Anticarsia gemmatalis*)、果樹黃捲蛾(*Archips argyrospila*)、玫瑰黃捲蛾(*Archips rosana*)、桔帶卷蛾(*Argyrotaenia citrana*)、伽馬紋夜蛾(*Autographa gamma*)、捲葉蛾(*Bonagota cranaodes*)、禾弄蝶(*Borbo cinnara*)、棉潛蛾(*Bucculatrix thurberiella*)、菸卷蛾(*Capua reticulana*)、桃蛀果蛾(*Carposina niponensis*)、芒果螟蛾(*Chlumetia transversa*)、玫瑰色卷蛾(*Choristoneura rosaceana*)、稻縱卷葉螟(*Cnaphalocrocis medinalis*)、可可細蛾(*Conopomorpha cramerella*)、芳香木蠹蛾(*Cossus cossus*)、石核桃卷蛾(*Cydia caryana*)、李小食心蟲(*Cydia funebrana*)、梨小食心蟲(*Cydia molesta*)、豌豆小卷蛾(*Cydia nigricana*)、蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella*)、茶刺蛾(*Darna diducta*)、小蔗桿草螟(*Diatraea saccharalis*)、西南玉米桿草螟(*Diatraea graniosella*)、埃及鑽夜蛾(*Earias insulata*)、翠紋鑽夜蛾(*Earias vitella*)、對小卷蛾(*Ecdytolopha aurantianum*)、南美玉米苗斑螟(*Elasmopalpus lignosellus*)、粉斑螟(*Ephestia cautella*)、菸草粉斑螟(*Ephestia elutella*)、地中海粉螟(*Ephestia kuehniella*)、大豆捲葉蛾(*Epinotia aporema*)、淡棕蘋果蛾(*Epiphyas postvittana*)、香蕉弄蝶(*Erionota thrax*)、女貞細卷蛾(*Eupoecilia ambiguella*)、原切根蟲(*Euxoa auxiliaris*)、桃折心蟲(*Grapholita molesta*)、三紋螟蛾(*Hedylepta*

indicata)、棉鈴蟲(*Helicoverpa armigera*)、棉鈴實夜蛾(*Helicoverpa zea*)、菸芽夜蛾(*Heliothis virescens*)、菜心野螟(*Hellula undalis*)、番茄蠹蛾(*Keiferia lycopersicella*)、茄螟蛾(*Leucinodes orbonalis*)、咖啡潛葉蛾(*Leucoptera coffeella*)、旋紋潛蛾(*Leucoptera malifoliella*)、葡萄花翅小卷蛾(*Lobesia botrana*)、豆白緣切根蟲(*Loxagrotis albicosta*)、舞毒蛾(*Lymantria dispar*)、桃潛葉蛾(*Lyonetia clerkella*)、蓑蛾(*Mahasena corbetti*)、甘藍夜蛾(*Mamestra brassicae*)、豆莢螟(*Maruca testulalis*)、袋蛾(*Metisa plana*)、栗夜盜蟲(*Mythimna unipuncta*)、番茄蛀蟲(*Neoleucinodes elegantalis*)、白水螟蛾(*Nymphula depunctalis*)、冬尺蠖蛾(*Operophtera brumata*)、歐洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis*)、大戟草尺蠖蛾(*Oxydia vesulia*)、疆褐卷蛾(*Pandemis cerasana*)、蘋褐卷蛾(*Pandemis heparana*)、非洲達摩鳳蝶(*Papilio demodocus*)、白咖啡潛夜蟲(*Pectinophora gossypiella*)、雜色夜蛾(*Peridroma saucia*)、咖啡潛葉蛾(*Perileucoptera coffeella*)、馬鈴薯蠹蛾(*Phthorimaea operculella*)、柑橘潛夜蛾(*Phyllocnistis citrella*)、紋白蝶(*Pieris rapae*)、苜蓿綠夜蛾(*Plathypena scabra*)、印度穀螟蛾(*Plodia interpunctella*)、小菜蛾(*Plutella xylostella*)、葡萄捲葉蛾(*Polychrosis viteana*)、桔果巢蛾(*Prays endocarpa*)、油橄欖巢蛾(*Prays oleae*)、一星黏蟲(*Pseudaletia*

unipuncta)、大豆夜蛾(*Pseudoplusia includens*)、向日葵尺蠖(*Rachiplusia nu*)、三化螟(*Scirpophaga incertulas*)、稻蛀莖夜蛾(*Sesamia inferens*)、西非蛀莖夜蛾(*Sesamia nonagrioides*)、蕁麻毛蟲(*Setora nitens*)、麥蛾(*Sitotroga cerealella*)、葡萄長鬚卷葉蛾(*Sparganothis pilleriana*)、甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua*)、草地貪夜蛾(*Spodoptera fugiperda*)、南部灰翅夜蛾(*Spodoptera eridania*)、菠蘿褐灰蝶(*Thecla basilides*)、袋衣蛾(*Tineola bisselliella*)、粉斑夜蛾(*Trichoplusia ni*)、番茄斑潛蠅(*Tuta absoluta*)、咖啡豹蠹蛾(*Zeuzera coffeae*)以及梨豹蠹蛾(*Zeuzera pyrina*)；

(12)食毛目(Order Mallophaga)。特定屬之非窮舉性清單包括但不限於，細鵝虱屬(*Anaticola* spp.)、牛毛虱屬(*Bovicola* spp.)、大火雞虱屬(*Chelopistes* spp.)、雞角羽虱(*Goniodes* spp.)、雞虱屬(*Menacanthus* spp.)及犬毛虱屬(*Trichodectes* spp.)。特定物種之非窮舉性清單包括但不限於，牛羽虱(*Bovicola bovis*)、山羊住牛虱(*Bovicola caprae*)、綿羊虱(*Bovicola ovis*)、大火雞虱(*Chelopistes meleagridis*)、雞角羽虱(*Goniodes dissimilis*)、大角羽虱(*Goniodes gigas*)、雛雞羽蝨(*Menacanthus stramineus*)、雞羽虱(*Menopon gallinea*)以及犬嚙毛虱(*Trichodectes canis*)。

(13)直翅目(Order Orthoptera)。特定屬之非窮舉性清單包括但不限於，黑蝗屬(*Melanoplus* spp.)及側羽葉屬

(*Pterophylla* spp.)。特定物種之非窮舉性清單包括但不限於，摩門蝨斯(*Anabrus simplex*)、非洲螻蛄(*Gryllotalpa africana*)、南方螻蛄(*Gryllotalpa australis*)、黑短螻蛄(*Gryllotalpa brachyptera*)、歐洲痣蟋蟀(*Gryllotalpa hexadactyla*)、東亞飛蝗(*Locusta migratoria*)、角翅蝨斯(*Microcentrum retinerve*)、沙漠蝗(*Schistocerca gregaria*)，以及叉尾灌叢樹蝨(*Scudderia furcata*)。

(14) 蚤目(Order Siphonaptera)。特定物種之非窮舉性清單包括但不限於，雞角葉蚤(*Ceratophyllus gallinae*)、黑角葉蚤(*Ceratophyllus niger*)、犬櫛頭蚤(*Ctenocephalides canis*)、貓櫛頭蚤(*Ctenocephalides felis*)，以及人蚤(*Pulex irritans*)。

(15)管口水蚤目(Order Siphonostomatoida)。特定物種之非窮舉性清單包括但不限於，鮭魚虱(*Lepeophtheirus salmonis*)、*Lepeophtheirus pectoralis*、細長魚虱(*Caligus elongatus*)，以及*Caligus clemensi*。

(16)縷翅目(Order Thysanoptera)。特定屬之非窮舉性清單包括但不限於，巢針薊馬屬(*Caliothrips* spp.)、花薊馬屬(*Frankliniella* spp.)、跳薊馬屬(*Scirtothrips* spp.)及薊馬屬(*Thrips* spp.)。特定物種之非窮舉性清單包括但不限於，菸褐花薊馬(*Frankliniella fusca*)、西方花薊馬(*Frankliniella occidentalis*)、梳缺花薊馬(*Frankliniella schultzei*)、威廉斯花薊馬(*Frankliniella williamsi*)、變

葉木薊馬 (*Heliothrips haemorrhaidalis*)、腹鉤薊馬 (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、桔硬薊馬 (*Scirtothrips citri*)、小黃薊馬 (*Scirtothrips dorsalis*)、帶薊馬 (*Taeniothrips rhopalantennalis*)、黃胸薊馬 (*Thrips hawaiiensis*)、豆黃薊馬 (*Thrips nigropilosus*)、東方薊馬 (*Thrips orientalis*)，以及菸薊馬 (*Thrips tabaci*)。

(17) 纓尾目 (Order Thysanura)。特定屬之非窮舉性清單包括但不限於，衣魚屬 (*Lepisma* spp.) 以及小灶衣魚屬 (*Thermobia* spp.)。

(18) 蜱蟎目 (Order Acarina)。特定屬之非窮舉性清單包括但不限於，粉蟎屬 (*Acarus* spp.)、刺皮節蜱屬 (*Aculops* spp.)、牛蜱蝨屬 (*Boophilus* spp.)、蠕形蟎屬 (*Demodex* spp.)、革蜱屬 (*Dermacentor* spp.)、上癭蟎屬 (*Epitimerus* spp.)、節蜱屬 (*Eriophyes* spp.)、硬蜱屬 (*Ixodes* spp.)、赤葉蟎屬 (*Oligonychus* spp.)、全爪蟎屬 (*Panonychus* spp.)、扇頭蜱屬 (*Rhizoglyphus* spp.) 及葉蟎屬 (*Tetranychus* spp.)。特定物種之非窮舉性清單包括但不限於，伍德氏蟎 (*Acarapis woodi*)、粗腳粉蟎 (*Acarus siro*)、芒果瘤癭蟎 (*Aceria mangiferae*)、番茄刺皮癭蟎 (*Aculops lycopersici*)、皮氏刺皮癭蟎 (*Aculus pelekassi*)、斯氏刺癭蟎 (*Aculus schlechtendali*)、美洲鈍眼蜱 (*Amblyomma americanum*)、卵形短鬚蟎 (*Brevipalpus obovatus*)、紫紅短鬚蟎 (*Brevipalpus phoenicis*)、變異革蜱 (*Dermacentor variabilis*)、歐洲室

塵蟎(*Dermatophagoides pteronyssinus*)、鵝耳櫪始葉蟎(*Eotetranychus carpini*)、貓節痂蟎(*Notoedres cati*)、茶紅葉蟎(*Oligonychus coffeae*)、伊氏赤葉蟎(*Oligonychus ilicis*)、柑橘葉蟎(*Panonychus citri*)、歐洲葉蟎(*Panonychus ulmi*)、柑桔皺葉刺節蟬(*Phyllocoptruta oleivora*)、側多食跗線蟎(*Polyphagotarsonemus latus*)、血紅扇頭蟬(*Rhipicephalus sanguineus*)、人疥蟎(*Sarcoptes scabiei*)、鱧梨頂冠癭蟎(*Tegolophus perseae*)、二點葉蟎(*Tetranychus urticae*)，以及狄氏瓦蟎(*Varroa destructor*)。

(19) 結閥綱(Class Symphyla)。特定物種之非窮舉性清單包括但不限於，白松蟲(*Scutigera immaculata*)。

(20) 圓形動物門(Phylum Nematoda)。特定屬之非窮舉性清單包括但不限於，線蟲屬(*Aphelenchoides* spp.)、刺線蟲屬(*Belonolaimus* spp.)、小環線蟲屬(*Criconemella* spp.)、莖線蟲屬(*Ditylenchus* spp.)、孢囊線蟲屬(*Heterodera* spp.)、潛根線蟲屬(*Hirschmanniella* spp.)、紐帶線蟲屬(*Hoplolaimus* spp.)、根瘤線蟲屬(*Meloidogyne* spp.)、根腐線蟲屬(*Pratylenchus* spp.)及穿孔線蟲屬(*Radopholus* spp.)。特定物種之非窮舉性清單包括但不限於，犬惡絲蟲(*Dirofilaria immitis*)、玉米胞囊線蟲(*Heterodera zeae*)、南方根結線蟲(*Meloidogyne incognita*)、爪哇根

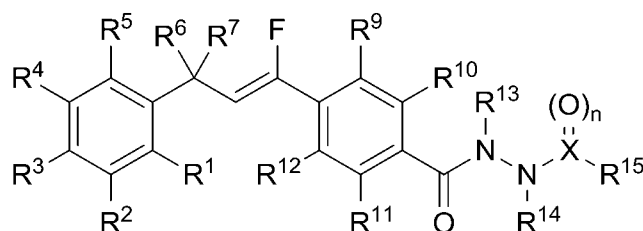
瘤線蟲 (*Meloidogyne javanica*)、人蟠尾絲蟲 (*Onchocerca volvulus*)、相似穿孔線蟲 (*Radopholus similis*)以及腎狀線蟲(*Rotylenchus reniformis*)。

【0037】用語「殺蟲有效量」意指對害蟲達成可觀察到的效應所需要的殺蟲劑量，舉例而言壞死、死亡、遲緩、預防、移除、破壞的效應，不然就是能減少害蟲於一所在地的發生及/或害蟲的活性，於一所在地驅逐害蟲族群，害蟲於一所在地或附近無行為能力，以及/或是害蟲於一所在地或附近消滅的時候，可產生此效應。當然，可發生此等效應之組合。一般而言，害蟲族群、活性或是二者都希望降低超過百分之五十，較佳為超過百分之九十，且最佳為超過百分之九十九。通常，對於農業目的，殺蟲有效量為從大約每公頃0.0001公克至大約每公頃5000公克，較佳為從大約每公頃0.0001公克至大約每公頃500公克，以及還更佳為從大約每公頃0.0001公克至大約每公頃50 公克。

較佳實施例之詳細說明

本揭示之詳細說明

【0038】本文件揭示式1分子



式1

其中：

(A) R^1 、 R^5 、 R^6 、 R^{11} 及 R^{12} 各自獨立地選自於下列所構成的群組：H、F、Cl、Br、I、CN、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 鹵烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基，以及 (C_1-C_4) 鹵烷氧基；

(B) R^2 、 R^3 及 R^4 各自獨立地選自於下列所構成的群組：H、F、Cl、Br、I、CN、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_1-C_4) 鹵烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基，以及 (C_1-C_4) 鹵烷氧基；

(C) R^7 為 (C_1-C_6) 鹵烷基；

(D) R^9 係選自於下列所構成的群組：(F)、H、F、Cl、Br、I、CN、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 鹵烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基，以及 (C_1-C_4) 鹵烷氧基；

(E) R^{10} 係選自於下列所構成的群組：(F)、F、Cl、Br、I、CN、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_1-C_4) 鹵烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基，以及 (C_1-C_4) 鹵烷氧基；

(F) R^9 及 R^{10} 能選擇性地一起形成一個3至5員飽和或不飽和的、烴基(hydrocarbyl)鍵聯，

其中該烴基鍵聯可選擇性地以一個或更多個獨立地選自於下列所構成的群組之取代基予以取代：F、Cl、Br、I及CN；

(G) R^{13} 及 R^{14} 各自獨立地選自於下列所構成的群組：H、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_1-C_4) 鹵烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基，以及 (C_1-C_4) 鹵烷氧基；

(H) X係選自於下列所構成的群組：C、S及P(C_1-C_6)烷基；

(I) n 為 1 或 2 ；

(J) R^{15} 係選自於下列所構成的群組：(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 烯基、(C₁-C₄) 鹵烷基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 鹵烷氧基、苯基及 NH(C₁-C₄) 鹵烷基，

其中各個烷基、烯基、鹵烷基、烷氧基、鹵烷氧基及苯基可以選擇性地以一個或更多個獨立地選自於下列所構成的群組之取代基予以取代：F、Cl、Br、I、CN 及 OH；以及

該式 1 分子之農業上可接受的酸加成鹽類、鹽類衍生物、溶劑合物、酯類衍生物、結晶性多形體、同位素、解析的立體異構物，以及互變異構物。

【0039】在另一個具體例中， R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^9 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 及 R^{14} 為 H。此具體例可與 R^2 、 R^7 、 R^{10} 、 R^{15} 、X，及 n 之其他具體例組合使用。

【0040】在另一個具體例中， R^2 為 Cl、Br 或 CH₃。此具體例可與 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、X，及 n 之其他具體例組合使用。

【0041】在另一個具體例中， R^3 為 F、Cl、Br 或 CH=CH₂。此具體例可與 R^1 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、X，及 n 之其他具體例組合使用。

【0042】在另一個具體例中， R^4 為 Cl、Br 或 CH₃。此具體例可與 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、X，及 n 之其他具體例組合使用。

【0043】在另一個具體例中， R^2 、 R^3 及 R^4 為Cl。此具體例可與 R^1 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、X，及n之其他具體例組合使用。

【0044】在另一個具體例中， R^7 為(C₁-C₆)鹵烷基。此具體例可與 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、X，及n之其他具體例組合使用。

【0045】在另一個具體例中， R^7 為CF₃或CF₂CH₃。此具體例可與 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、X，及n之其他具體例組合使用。

【0046】在另一個具體例中， R^{10} 為Cl、Br、I、CH₃或CF₃。此具體例可與 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、X，及n之其他具體例組合使用。

【0047】在另一個具體例中， R^{13} 或 R^{14} 為CH₃。此具體例可與 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{15} 、X，及n之其他具體例組合使用。

【0048】在另一個具體例中，X為C或S。此具體例可與 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} ，及n之其他具體例組合使用。

【0049】在另一個具體例中，n為1或2。此具體例可與 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} ，及X之其他具體例組合使用。

【0050】在另一個具體例中， R^{15} 為CH₂CH₂CF₃或NHCH₂CF₃。此具體例可與 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、

R^7 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 X ，及 n 之其他具體例組合使用。

【0051】在另一個具體例中：

(A) R^1 、 R^5 、 R^6 、 R^{11} 及 R^{12} 為H；

(B) R^2 、 R^3 及 R^4 各自獨立地選自於下列所構成的群組：H、F、Cl、Br、I、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基以及 (C_1-C_4) 鹵烷基；

(C) R^7 為 (C_1-C_6) 鹵烷基；

(D) R^9 為H；

(E) R^{10} 係選自於下列所構成的群組：H、F、Cl、Br、I、 (C_1-C_4) 烷基以及 (C_1-C_4) 鹵烷基；

(G) R^{13} 及 R^{14} 各自獨立地選自於下列所構成的群組：H及 (C_1-C_4) 烷基；

(H) X 係選自於下列所構成的群組：C及S；

(I) n 為1或2；以及

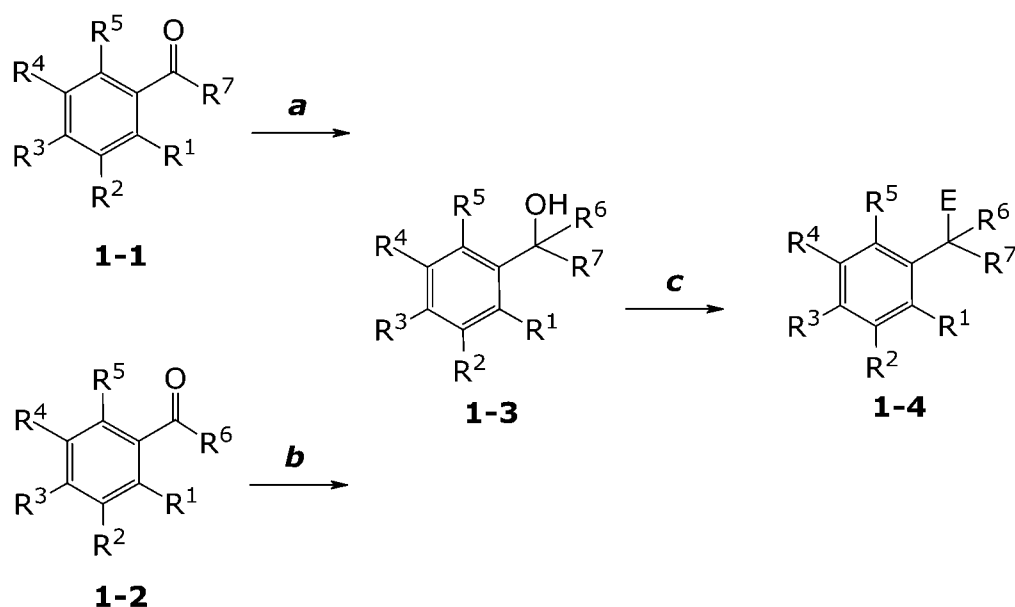
(J) R^{15} 係選自於下列所構成的群組： (C_1-C_4) 鹵烷基及 $NH(C_1-C_4)$ 鹵烷基。

苯甲基鹵化物之製備

【0052】苯甲基鹵化物1-3，其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 係如先前所揭示，可以用數種方式製備。酮1-1之製備可以在大約-78 °C至大約0 °C的溫度下，於極性非質子溶劑，較佳為二乙基醚內，用鋰鹼例如正丁基鋰來處理溴苯，接著以酯類 $R^7C(O)O(C_1-C_4)$ 烷基，其中 R^7 係如先前所揭示，例如2,2-二氟化丙酸乙酯(未顯示)予以處

理。在大約-10 °C至大約10 °C下，於極性質子溶劑，較佳為甲醇內，在一種鹼諸如含水氫氧化鈉存在下，用一種還原劑，諸如硼氫化鈉來處理酮**1-1**，其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及 R^7 係如先前所揭示，可以提供苯甲醇類**1-3**(流程圖1，步驟*a*)。任擇地，可以於極性非質子溶劑，較佳為四氫呋喃內，在一種催化量的四丁基氟化銨存在下，讓醛**1-2**，其中 R^6 為H且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及 R^5 係如先前所揭示，與三氟三甲基矽烷反應(流程圖1，步驟*b*)，以提供苯甲醇類**1-3**，其中 R^7 為 CF_3 。隨後，苯甲醇類**1-3**可以轉化成苯甲基鹵化物**1-4**，其中E為Br、Cl或I，且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 係如先前所揭示，其係透過於大概40 °C下，在不會與試劑反應的溶劑，較佳為二氯甲烷內，用一種鹵化試劑諸如*N*-溴琥珀醯亞胺，及亞磷酸三乙酯予以處理，以提供苯甲基鹵化物**1-4**，E為Br(流程圖1，步驟*c*)。任擇地，苯甲醇類**1-3**可以轉化成苯甲基鹵化物**1-4**，其中E為Br，其係透過於一種鹼諸如三乙胺存在下，用一種磺醯氯諸如甲磺醯氯來處理，然後用一種過渡金屬溴化物劑諸如溴化鐵(III)來處理生成的磺酸。此外，在大約110 °C下，於一種烴溶劑諸如甲苯內，於一種鹼諸如吡啶存在下，用氯化試劑諸如亞硫醯氯予以處理，可以提供苯甲基鹵化物**1-4**，其中E為Cl(流程圖1，步驟*c*)。

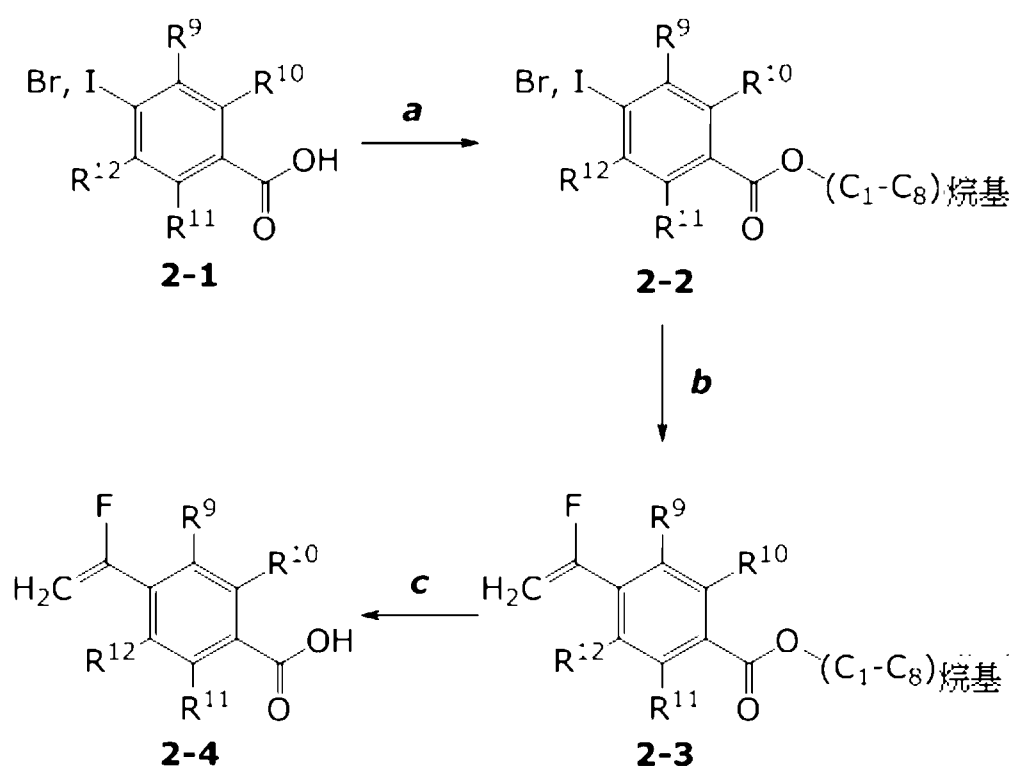
流程圖1



氟化乙烷基苯甲酯及酸之製備

【0053】 鹵苯甲酸**2-1**，其中 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 及 R^{12} 係如先前所揭示，可以轉化成鹵苯甲酸酯**2-2**，其中 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 及 R^{12} 係如先前所揭示。鹵苯甲酸**2-1**可以在一種(C₁-C₈)醇諸如乙醇存在下，用一種酸諸如硫酸予以處理，以提供鹵苯甲酸乙基酯**2-2**(流程圖2，步驟a)。氟化乙烷基苯甲酸酯**2-3**可以經由在溫度範圍從大約周圍溫度至大約45 °C下，於一種極性非質子溶劑，較佳為1,3-二甲-2-咪唑啉酮內，在鈀催化劑如四(三苯基膦)鈀(0)、銅添加劑如碘化銅(I)以及氟化物源諸如氟化銫之存在下，使**2-2**與一種氟化乙烷基矽烷反應而取得，以提供氟化乙烷基苯甲酸酯**2-3**(流程圖2，步驟b)。氟化乙烷基苯甲酸酯**2-3**可以在大約周圍溫度下，於一種混合溶劑系統內，該混合溶劑系統包含極性非質子溶劑較佳為四氫呋喃以及極性質子溶劑較佳為甲醇與水，用一種金屬氫氧化物源如氫氧化鋰予以處理，以提供氟化乙烷基苯甲酸**2-4**(流程圖2，步驟c)。

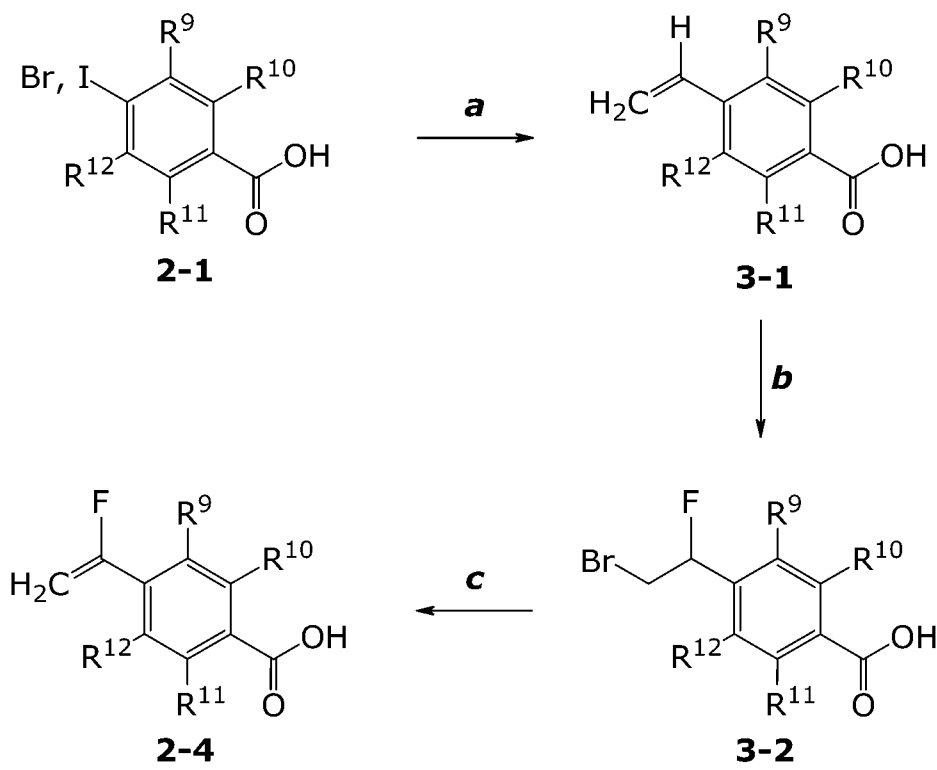
流程圖2



【0054】任擇地，鹵苯甲酸**2-1**可以在溫度範圍從大約80℃至大約140℃下，於一種極性非質子溶劑較佳為二甲亞砜內，在一種鈰催化劑，例如1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵二氯化鈰(II)，以及一種鹼諸如碳酸鉀的存在下，直接用一種乙烯基硼烷源，例如乙烯基三氟硼酸或3-羥基-2,3-二甲基二級丁基氫乙烯基硼酸酯(3-hydroxy-2,3-dimethylbutan-2-yl hydrogen vinylboronate)予以處理，以提供乙烯基苯甲酸**3-1**，其中**R⁹**、**R¹⁰**、**R¹¹**及**R¹²**係如先前所揭示(流程圖3，步驟a)。乙烯基苯甲酸**3-1**可以在大約0℃下，於極性非質子溶劑，較佳為二氯甲烷內，用溴源諸如*N*-溴琥珀醯亞胺，及一種氟源諸如三乙胺三氟化氫予以處理，以提供溴氟烷基苯甲酸**3-2**，其中**R⁹**、**R¹⁰**、**R¹¹**及**R¹²**係如先前所揭示(流程圖3，步驟b)。溴氟

烷基苯甲酸**3-2**可以在溫度範圍從大約0℃至大約周圍溫度下，於一種極性質子溶劑較佳為甲醇內，用一種鹼諸如第三丁氧基鉀予以處理，以提供氟化乙烯基苯甲酸**2-4**(流程圖3，步驟**c**)。

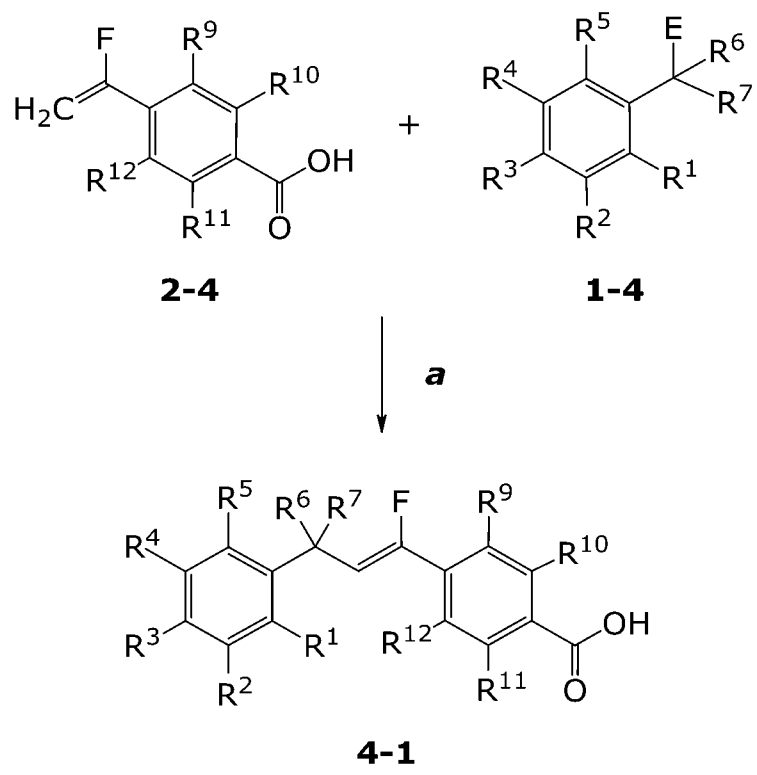
流程圖3



氟化苯基烯丙基苯甲酸之製備

【0055】 苯甲基鹵化物**1-4**及氟化乙烯基苯甲酸**2-4**可以在大約100℃至大約180℃的溫度下，於一種極性非質子溶劑，較佳為*N*-甲基-2-吡咯啉酮內，用一種銅(I)源例如氯化銅(I)或溴化銅(I)，及一種吡啶配位基例如2,2-聯吡啶來處理，以提供氟化苯基烯丙基苯甲酸**4-1**，其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} ，及 R^{12} 係如先前所揭示(流程圖4，步驟**a**)。

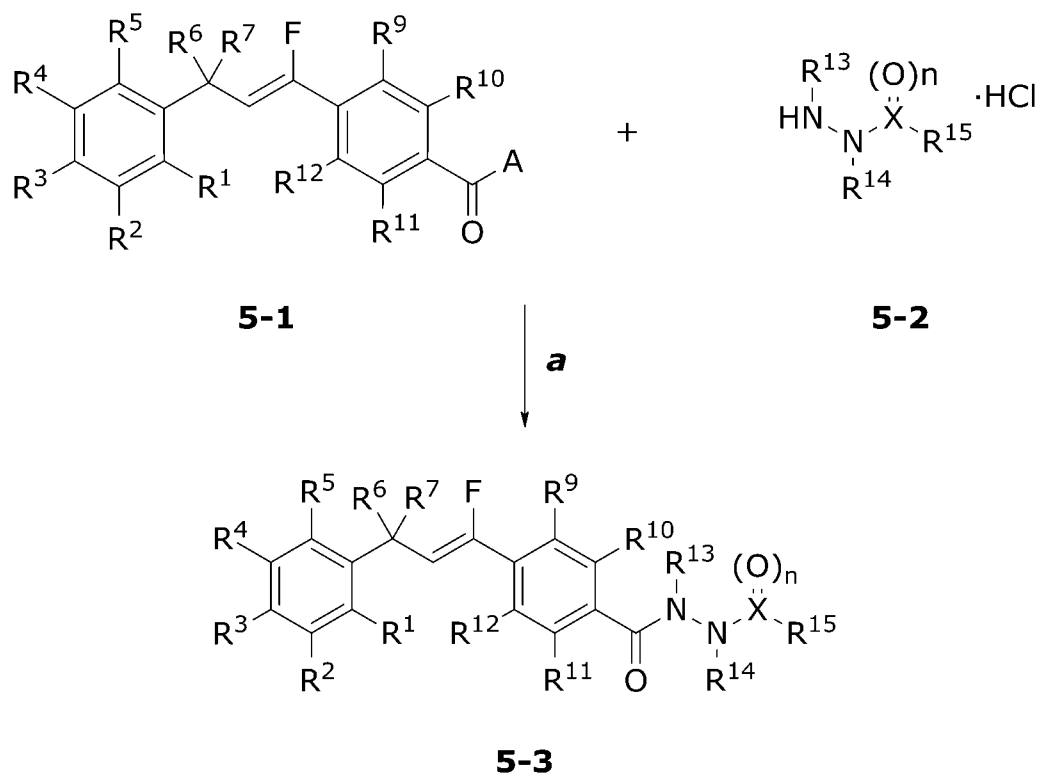
流程圖4



氟化苯基烯丙基苯甲醯胺之製備

【0056】 苯基烯丙基苯甲醯胺**5-3**，其中R¹³是H且R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹⁴、X、n及R¹⁵係如先前所揭示，之製備可以透過在大約0℃至大約120℃之間的溫度下，於一種無水極性、非質子溶劑，較佳為二氯甲烷、四氫呋喃、1,2-二氯乙烷或N,N-二甲基甲醯胺內，以一種鹼諸如三乙胺、二異丙基乙胺或4-甲基嗎福林，來處理胺或胺鹽**5-2**，其中R¹⁴、X、n，及R¹⁵係如先前所揭示，以及活性的羧酸**5-1**，其中A為一活化基團且R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁹、R¹⁰、R¹¹及R¹²係如先前所揭示(流程圖5，步驟a)。

流程圖5



【0057】活性的羧酸**5-1**可以為一種酸性鹵化物，例如一酸性氯化物、酸性溴化物或酸性氟化物；一種羧酸酯，例如對硝基苯酯、五氟苯酯、乙基(羥亞胺基)氰乙酸酯、甲酯、乙酯、苯甲酯、*N*-羥琥珀醯亞胺酯、羥苯并三唑-1-基酯，或是羥吡啶基三唑-1-基酯；鄰醯基異脲(*O*-acylisourea)；一種酸酐；或是一種硫酯。酸性氯化物**5-1**可從對應的羧酸製備，其係透過用一種脫水、氯化試劑諸如草醯氯或是亞硫醯氯來處理。活性的羧酸**5-1**可於原位、用一種脲鹽(uronium salt)例如2-(7-氧化苯并三氮唑)-*N,N,N',N'*-四甲基脲六氟磷酸酯(1-[bis(dimethylamino)methylene]-1*H*-1,2,3-triazolo[4,5-*b*]pyridinium 3-oxid hexafluorophosphate) (HATU)、*O*-(苯并三唑-1-基)-*N,N,N',N'*-四甲基脲六氟磷酸酯(HBTU)，

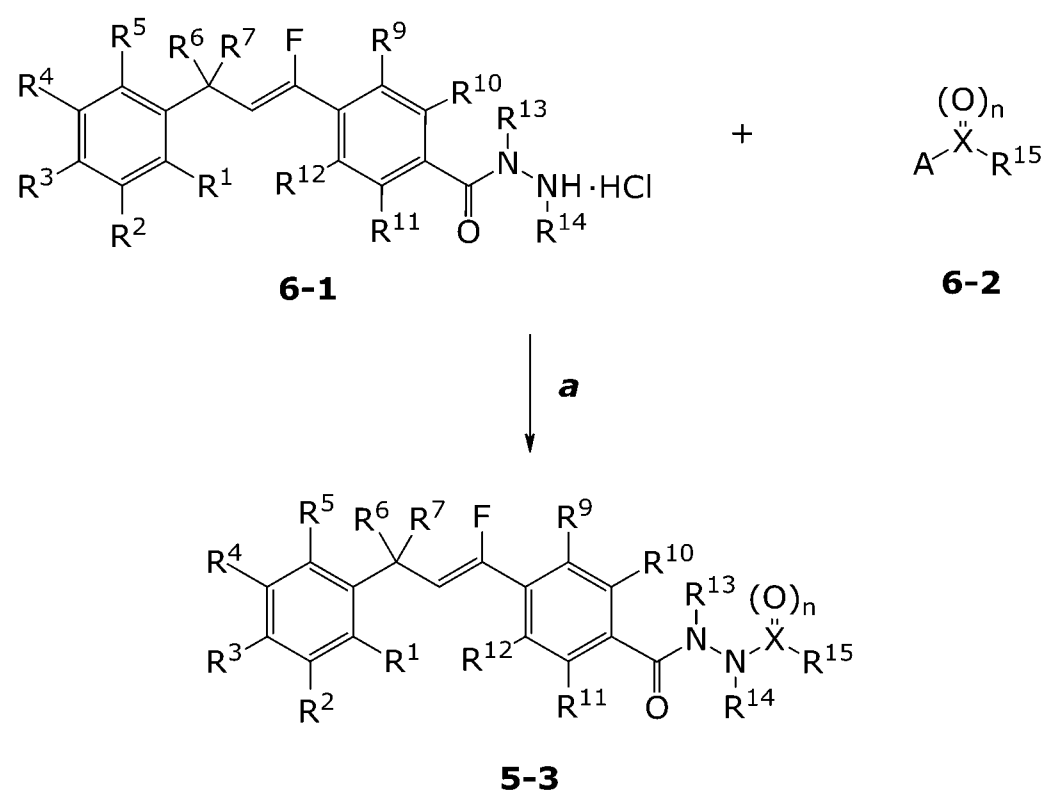
或(1-氰基-2-乙氧基-2-側氧亞乙基胺基氧基)二甲基胺基-嗎福啉基-碳鎗六氟磷酸酯(COMU)，而從羧酸製備。活性的羧酸**5-1**亦可從羧酸於原位、用一種磷鹽例如苯并三唑-1-基-氧三吡咯啉并鎗六氟磷酸酯(benzotriazol-1-yl-oxytripyrrolidinophosphonium hexafluorophosphate) (PyBop)，而製備。活性的羧酸**5-1**亦可從羧酸於原位、於一種三唑，如羥苯并三唑·一水合物(HOBt)或1-羥-7-偶氮苯并三唑(HOAt)存在下，用一種耦合試劑例如1-(3-二甲基胺丙基)-3-乙基碳二亞胺(EDC)或二環己基碳二亞胺(DCC)，來製備。鄰醯基異脲(*O*-Acylisourea)可以用一種脫水碳二亞胺，諸如1-(3-二甲基胺丙基)-3-乙基碳二亞胺或二環己基碳二亞胺來製備。活性的羧酸**5-1**亦可從羧酸於原位、於一種三唑如1-羥-7-偶氮苯并三唑(HOAt)存在下，用一種耦合試劑例如2-氯-1,3-二甲基咪唑鎗六氟磷酸酯(2-Chloro-1,3-dimethylimidazolidinium hexafluorophosphate) (CIP)，來製備。

【0058】胺或胺鹽**5-2**可藉由用一種酸如氯化氫予以處理，而於原位、從對應的*N*-三級丁氧基羰基胺來產生。選擇性地，於一種鹼諸如碳酸氫鈉或三乙胺存在下，在與活性的羧酸**5-1**反應之前，或是在與活性的羧酸**5-1**反應的期間於原位，可以使胺鹽**5-2**成為游離基的(*free-based*)，來提供苯基烯丙基苯甲醯胺**5-3**。

【0059】任擇地，氟化苯基烯丙基苯甲醯胺**5-3**之製

備可以透過在大約 0°C 至大約 120°C 之間的溫度下，於一種無水極性、非質子溶劑，較佳為二氯甲烷、四氫呋喃、1,2-二氯乙烷或 N,N -二甲基甲醯胺內，以一種鹼諸如三乙胺、二異丙基乙胺或4-甲基嗎福林，來處理胺或胺鹽**6-1**，其中 R^{13} 是H且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{14} 係如先前所揭示，以及活性的羧酸**6-2**，其中A為活化基團且X、n，及 R^{15} 係如先前所揭示(流程圖6，步驟a)。氟化苯基烯丙基苯甲醯胺**5-3**之製備亦可以透過在大約 0°C 至大約 120°C 之間的溫度下，於一種無水極性、非質子溶劑，較佳為二氯甲烷、四氫呋喃、1,2-二氯乙烷或 N,N -二甲基甲醯胺內，於一種鹼諸如三乙胺、二異丙基乙胺或4-甲基嗎福林存在下，用磺醯氯**6-2**，其中A為Cl，X為S，n為2，且 R^{15} 係如先前所揭示，來處理胺或胺鹽**6-1**(流程圖6，步驟a)。

流程圖6



【0060】活性的羧酸**6-2**可以為一種酸性鹵化物，例如酸性氯化物、酸性溴化物或酸性氟化物；一種羧酸酯，例如對硝基苯酯、五氟苯酯、乙基(羥亞胺基)氰乙酸酯、甲酯、乙酯、苯甲酯、*N*-羥琥珀醯亞胺酯、羥苯并三唑-1-基酯，或是羥吡啶基三唑-1-基酯；一種鄰醯基異脲(*O*-acylisourea)；一種酸酐；或是一種硫酯；一種胺甲酸酯如對硝基苯基胺甲酸酯。酸性氯化物可從對應的羧酸製備，其係透過用一種脫水氯化試劑，諸如草醯氯或是亞硫醯氯來處理。活性的羧酸**6-2**可於原位、用一種脲鹽(uronium salt)例如2-(7-氧化苯并三氮唑)-*N,N,N',N'*-四甲基脲六氟磷酸酯(1-[bis(dimethylamino)methylene]-1*H*-1,2,3-triazolo[

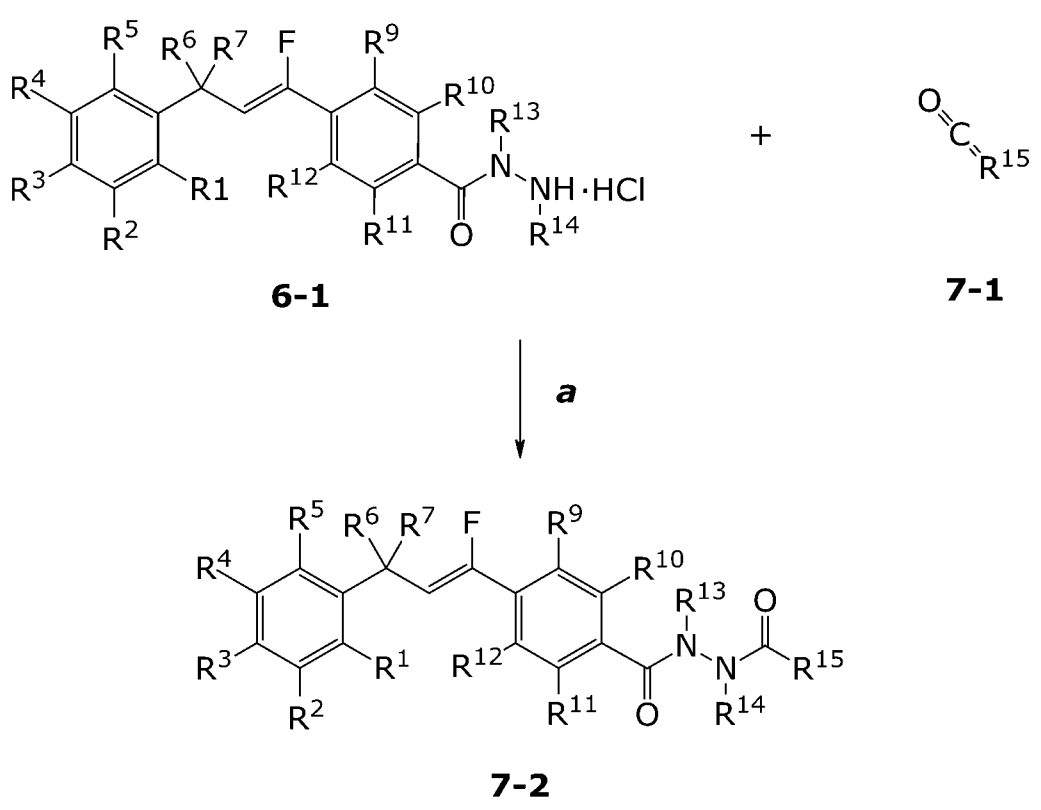
4,5-*b*]pyridinium 3-oxid hexafluorophosphate) (HATU)、*O*-(苯并三唑-1-基)-*N,N,N',N'*-四甲基脲六氟磷酸酯(HBTU)，或(1-氰基-2-乙氧基-2-側氧亞乙基胺基氧基)二甲基胺基-嗎福啉基-碳鎢六氟磷酸酯(COMU)，而從羧酸製備。活性的羧酸**6-2**亦可從羧酸於原位、用一種鎢鹽例如苯并三唑-1-基-氧三吡咯啉并鎢六氟磷酸酯(benzotriazol-1-yl-oxytripyrrolidinophosphonium hexafluorophosphate) (PyBop)，而製備。活性的羧酸**6-2**亦可從羧酸於原位、於一種三唑，如羥苯并三唑·一水合物(HOBt)或1-羥-7-偶氮苯并三唑(HOAt)存在下，用一種耦合試劑例如1-(3-二甲基胺丙基)-3-乙基碳二亞胺(EDC)或二環己基碳二亞胺(DCC)，來製備。鄰醯基異脲(*O*-Acylisourea)可以用一種脫水碳二亞胺，諸如1-(3-二甲基胺丙基)-3-乙基碳二亞胺(EDC)或二環己基碳二亞胺來製備(DCC)。活性的羧酸**6-2**亦可從羧酸於原位、於一種三唑如1-羥-7-偶氮苯并三唑(HOAt)存在下，用一種耦合試劑例如2-氯-1,3-二甲基咪唑六氟磷酸酯(2-Chloro-1,3-dimethylimidazolidinium hexafluorophosphate) (CIP)，來製備。

【0061】胺或胺鹽**6-1**可藉由用一種酸如氯化氫予以處理，而於原位、從對應的*N*-三級丁氧基羰基胺來產生。選擇性地，於一種鹼諸如碳酸氫鈉或三乙胺存在下，在與活性的羧酸**6-2**反應之前，或是在與活性的羧酸**6-2**反應的期間於原位，可使胺鹽**6-1**成為游離鹼的(*free-based*)，來

提供苯基烯丙基苯甲醯胺**5-3**。

【0062】 氟化苯基烯丙基苯甲醯胺**7-2**，其中 R^{13} 是 H、 X 是 C、 n 是 1、 R^{15} 是 $NH(C_1-C_6)$ 鹵烷基且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 及 R^{14} 係如先前所揭示，之製備可以透過在大約 $0^{\circ}C$ 及大約 $120^{\circ}C$ 之間的溫度下，於一種無水極性、非質子溶劑，較佳為二氯甲烷、四氫呋喃、1,2-二氯乙烷、*N,N*-二甲基甲醯胺或其等之任何組合內，以一種鹼諸如三乙胺、二異丙基乙胺或 4-甲基嗎福林，來處理胺或胺鹽**6-1**及異氰酸酯**7-1**，其中 R^{15} 是 $N(C_1-C_6)$ 鹵烷基(流程圖 7，步驟 *a*)。

流程圖 7



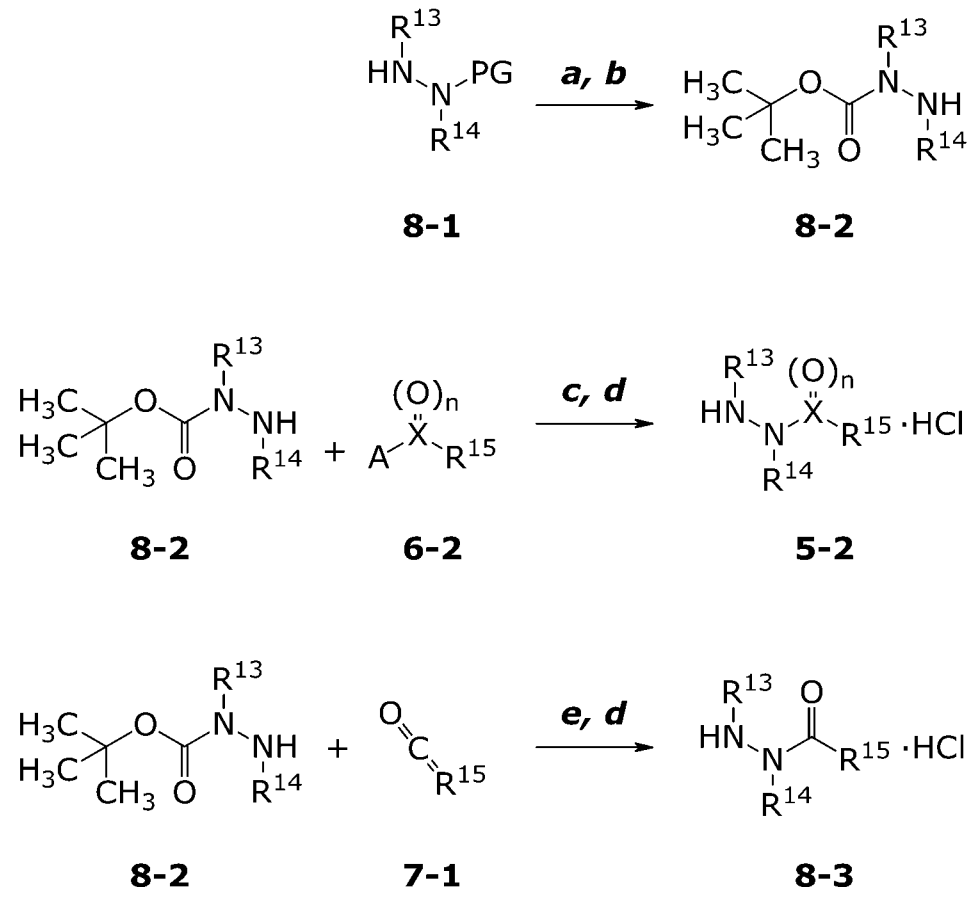
胺及胺鹽**5-2**之製備

【0063】 胺及胺鹽**5-2**可以如流程圖 8 中概述之途徑

予以製備。肼**8-1**，其中 R^{13} 為H、PG為保護基團諸如苯甲氧羰基，且 R^{14} 係如先前所揭示，可以於一種鹼諸如三乙胺、二異丙基乙胺或4-甲基嗎福林存在下，用一種羧酸酯源諸如二-三級丁基二碳酸酯 (di-*tert*-butyl dicarbonate)，來處理(流程圖8，步驟a)，接著在大約0℃至大約120℃之間的溫度下，於一種無水極性、非質子溶劑，較佳為二氯甲烷、四氫呋喃、1,2-二氯乙烷或*N,N*-二甲基甲醯胺內，用一種還原劑諸如氫氣及附於碳上之鈀來處理，以提供肼**8-2**，其中 R^{13} 為H且 R^{14} 係如先前所揭示(流程圖8，步驟b)。肼**8-2**可以於一種鹼諸如三乙胺、二異丙基乙胺或4-甲基嗎福林存在下，用活性的羧酸**6-2**予以處理(流程圖8，步驟c)，接著在大約0℃至大約120℃之間的溫度下，於一種無水極性、非質子溶劑，較佳為二氯甲烷、四氫呋喃、1,2-二氯乙烷或*N,N*-二甲基甲醯胺內，用一種酸如鹽酸予以處理，以提供胺及胺鹽**5-2**(流程圖8，步驟d)。

【0064】任擇地，肼**8-2**可以於一種鹼諸如三乙胺、二異丙基乙胺或4-甲基嗎福林存在下，以異氰酸酯**7-1**來處理(流程圖8，步驟e)，接著在大約0℃至大約120℃之間的溫度下，於一種無水極性、非質子溶劑，較佳為二氯甲烷、四氫呋喃、1,2-二氯乙烷或*N,N*-二甲基甲醯胺內，用一種酸如鹽酸予以處理，以提供肼或其等之鹽類**8-3**(流程圖8，步驟d)。

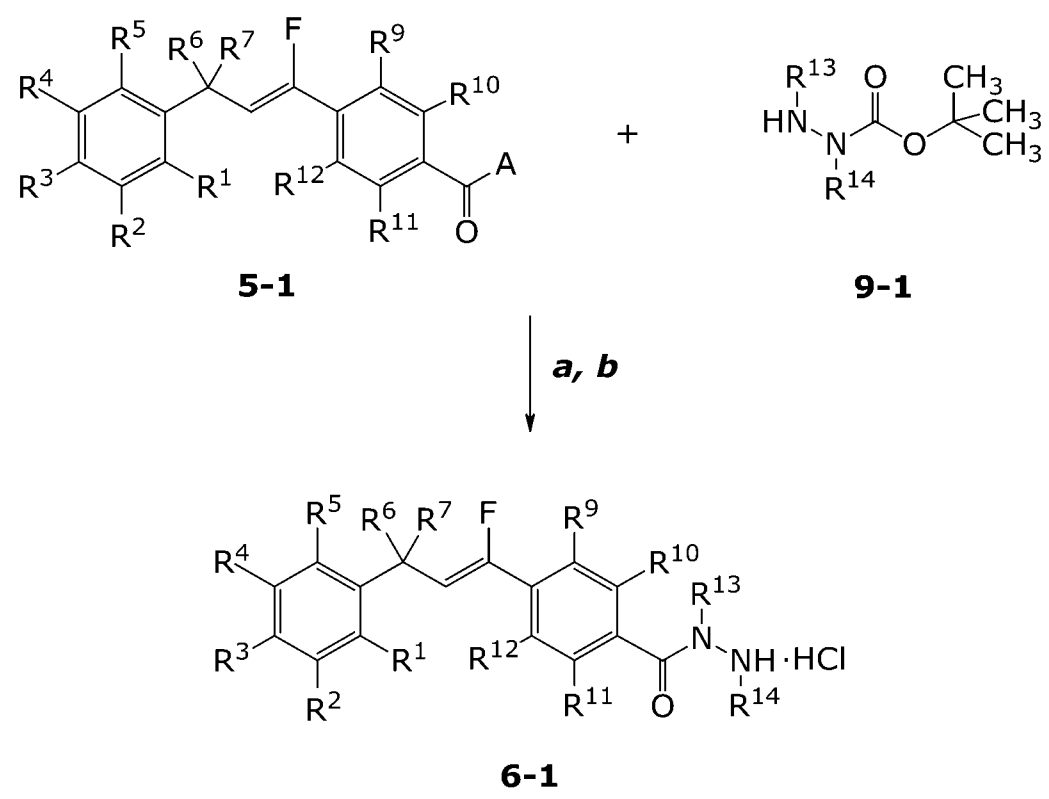
流程圖8



胺及胺鹽6-1之製備

【0065】活性的羧酸5-1可以於一種胺鹼諸如二異丙基乙胺或4-甲基嗎福林存在下，用胺或胺鹽9-1，其中R¹³為H且R¹⁴係如先前所揭示，予以處理(流程圖9，步驟a)，接著在大約0℃至大約120℃之間的溫度下，於一種無水極性、非質子溶劑，較佳為二氯甲烷、四氫呋喃、1,2-二氯乙烷或N,N-二甲基甲醯胺內，用一種酸如鹽酸予以處理，以提供胺及胺鹽6-1(流程圖9，步驟b)。

流程圖9



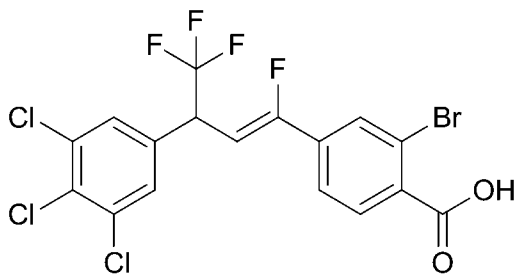
實施例

【0066】 此等實施例係為了說明之目的，而不應解釋為將本揭示限制為僅此等實施例中揭露的具體例。

【0067】 自商業來源獲得之起始原料、試劑及溶劑係未經進一步純化即使用。無水溶劑係購自Aldrich之Sure/Seal™，且以所收到的形式使用。熔點係於Thomas Hoover Unimelt毛細管熔點儀或是在Stanford Research Systems之OptiMelt自動化熔點系統上測得，及未經校正。使用「室溫」的實施例係在溫度範圍大約20 °C至大約24 °C的氣候控制實驗室中進行。分子係以其等依據ISIS Draw、ChemDraw或ACD Name Pro內的命名程式所命名之已知名稱顯示。若此等程式無法命名一分子，則此分子

係依習用的命名規則來命名。除非另有說明，否則¹H NMR 光譜數據係以ppm (δ)為單位及於300、400、500或600 MHz記錄；¹³C NMR光譜數據係以ppm (δ)為單位及於75、100或150 MHz記錄，以及¹⁹F NMR光譜數據係以ppm (δ)為單位及於376 MHz記錄。

實施例1：(Z)-2-溴-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)苯甲酸(C1)之製備

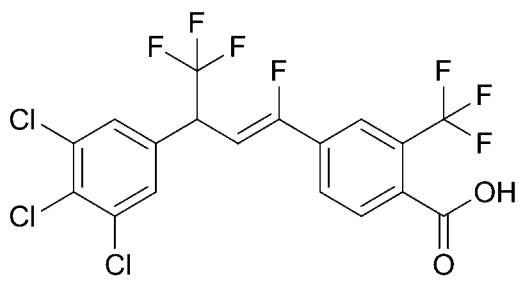


【0068】將配於*N*-甲基吡咯啉酮(2.0 mL)之2,2'-聯吡啶(0.255 g, 1.63 mmol)、2-溴-4-(1-氟乙基)苯甲酸(C24) (1.00 g, 4.08 mmol)及5-(1-溴-2,2,2-三氟乙基)-1,2,3-三氯苯(2.79 g, 8.16 mmol)添加至一個25 mL圓底燒瓶中，以提供黃色溶液。添加溴化銅(I) (0.117 g, 0.816 mmol)，以及反應混合物係用氮清洗5分鐘。反應繼而加熱至150 °C歷時3小時。將反應混合物傾注至冰水(100 mL)內。將水過濾以及使生成的黑色膠溶解於乙酸乙酯(800 mL)內，用鹽水(2 x 200 mL)及水(2 x 200 mL)清洗，於硫酸鎂上乾燥、過濾以及濃縮，以提供如棕色油之標題化合物(1.40 g, 64%): ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.03 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.89 (d, *J* = 1.8 Hz, 1H), 7.59 (dd, *J* = 8.3, 1.8 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 5.83 (dd, *J* = 32.4, 9.6

Hz, 1H), 4.60 (p, $J = 8.8$ Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -69.32 (d, $J = 2.3$ Hz), -108.70 – -119.01 (m); ESIMS m/z 505 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

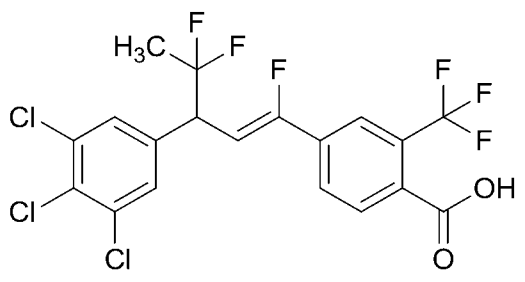
【0069】 下列化合物係以實施例1 中概述之流程相似的方式予以製備：

(Z)-4-(1,4,4,4- 四 氟 -3-(3,4,5- 三 氯 苯 基) 丁 -1- 烯 -1- 基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C2)



【0070】 單離為黃色油(7.6 g , 68%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.04 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H), 7.99 - 7.94 (m, 1H), 7.84 (dd, $J = 8.2, 1.8$ Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 5.90 (dd, $J = 32.4, 9.6$ Hz, 1H), 4.62 (p, $J = 8.9$ Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -59.60, -69.28 (d, $J = 2.3$ Hz), -112.11; ESIMS m/z 493 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

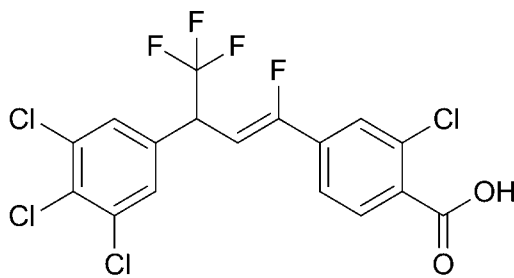
(Z)-4-(1,4,4- 三 氟 -3-(3,4,5- 三 氯 苯 基) 戊 -1- 烯 -1- 基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C3)



【0071】 單離為黃色泡沫(0.628 g , 60%): ^1H NMR

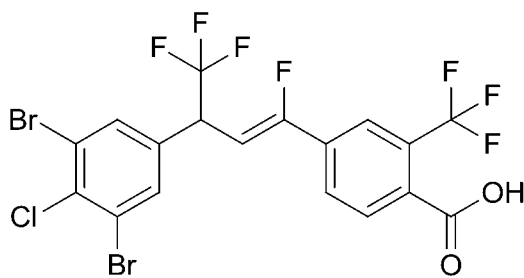
(400 MHz, CDCl_3) δ 8.00 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H), 7.95 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H), 7.81 (d, $J = 8.3$ Hz, 1H), 7.42 (s, 2H), 5.96 (dd, $J = 33.6, 9.8$ Hz, 1H), 4.29 (td, $J = 14.3, 9.8$ Hz, 1H), 1.65 (t, $J = 18.4$ Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -59.61, -92.97 – -97.35 (m), -114.82; ESIMS m/z 491 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

(Z)-2-氯-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)苯甲酸(C4)



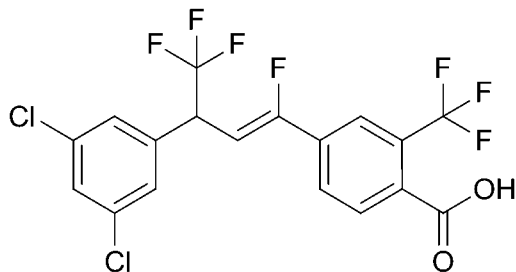
【0072】單離為白色固體(4.27 g, 88%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.07 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H), 7.68 (d, $J = 1.7$ Hz, 1H), 7.54 (dd, $J = 8.3, 1.8$ Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 5.85 (dd, $J = 32.4, 9.6$ Hz, 1H), 4.60 (p, $J = 8.8$ Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -69.33 (d, $J = 2.2$ Hz), -112.18 (d, $J = 2.4$ Hz); ESIMS m/z 461 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

(Z)-4-(3-(3,5-二溴-4-氯苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C5)



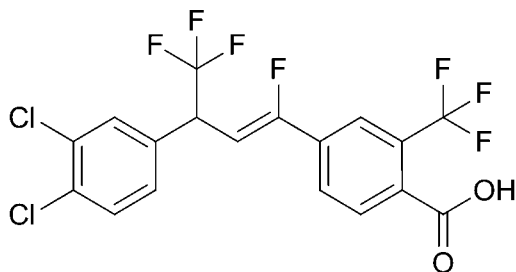
【0073】單離為棕色膠(2.00 g , 37%): ESIMS m/z 583 ($[M-H]^-$)。

(Z)-4-(3-(3,5-二氯苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C6)



【0074】單離為棕色膠(0.50 g , 43%): ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 13.9 (br s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.09 (d, $J = 8.0$ Hz, 1H), 7.92 (d, $J = 8.0$ Hz, 1H), 7.82 (s, 2H), 7.64 (t, $J = 6.0$ Hz, 1H), 6.90 (dd, $J = 36.0, 10.4$ Hz, 1H), 5.26 - 5.17 (m, 1H); IR(薄膜) 3416, 2926, 1716, 1119 cm^{-1} ; ESIMS m/z 449 ($[M+H]^+$)。

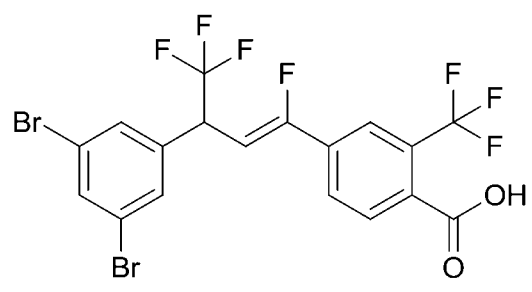
(Z)-4-(3-(3,4-二氯苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C7)



【0075】單離為棕色膠(2.50 g , 56%): ^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 13.9 (br s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.09 (d, $J = 10.8$ Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.92 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.75 - 7.65 (m, 2H), 6.90 (dd, $J = 36.0, 10.4$ Hz, 1H),

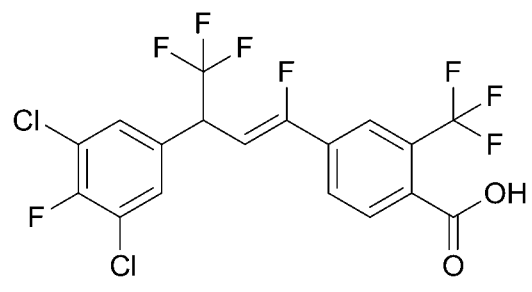
5.22 - 5.16 (m, 1H); IR(薄膜) 3440, 2927, 1716, 1175 cm^{-1} ; ESIMS m/z 459 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

(Z)-4-(3-(3,5-二溴苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C8)



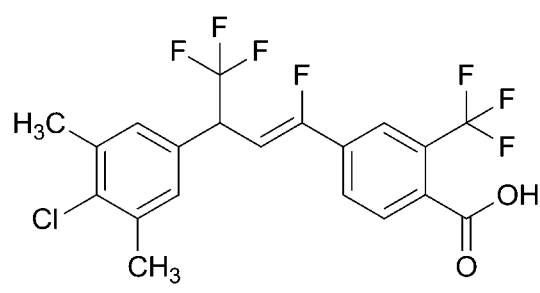
【0076】單離為棕色膠(2.20 g, 39%): ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.05 - 7.95 (m, 2H), 7.84 (d, $J = 7.2$ Hz, 1H), 7.69 - 7.68 (m, 1H), 7.49 (s, 2H), 5.95 (dd, $J = 32.7, 9.6$ Hz, 1H), 4.64 - 4.58 (p, 1H); IR(薄膜) 3439, 2925, 1714, 1118, 746 cm^{-1} ; ESIMS m/z 549 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

(Z)-4-(3-(3,5-二氯-4-氟苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C9)



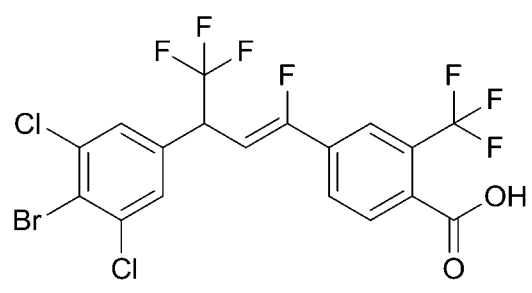
【0077】單離為棕色膠(1.20 g, 54%): ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 7.88 (s, 2H), 7.76 - 7.75 (m, 1H), 7.37 (d, $J = 6.0$ Hz, 2H), 5.90 (dd, $J = 32.1, 9.0$ Hz, 1H), 4.62 - 4.56 (p, 1H); IR(薄膜) 3445, 2926, 1698, 1260, 750 cm^{-1} ; ESIMS m/z 477 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

(Z)-4-(3-(4-氯-3,5-二甲基苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C10)



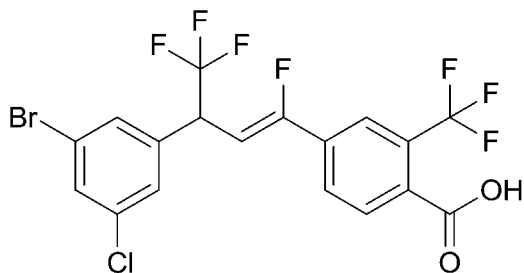
【0078】單離為黃色膠(2.20 g , 53%): ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 8.01 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.83 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.11 (s, 2H), 6.00 (dd, *J* = 33.0, 9.9 Hz, 1H), 4.58 - 4.55 (m, 1H), 2.40 (s, 6H); IR(薄膜) 3445, 1713, 852 cm⁻¹; ESIMS *m/z* 453 ([M-H]⁻)。

(Z)-4-(3-(4-溴-3,5-二氯苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C11)



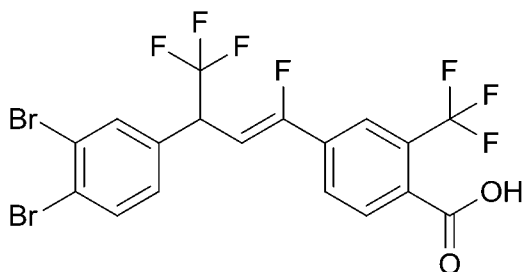
【0079】單離為棕色固體(1.50 g , 65%): mp 78-81 °C; ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 8.09 - 7.99 (m, 2H), 7.83 - 7.81 (m, 1H), 7.42 (s, 2H), 5.95 (dd, *J* = 32.4 Hz, 9.6 Hz, 1H), 4.63 - 4.57 (m, 1H); IR(薄膜) 3445, 1713, 852 cm⁻¹; ESIMS *m/z* 538 ([M+H]⁺)。

(Z)-4-(3-(3-溴-5-氯苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C12)



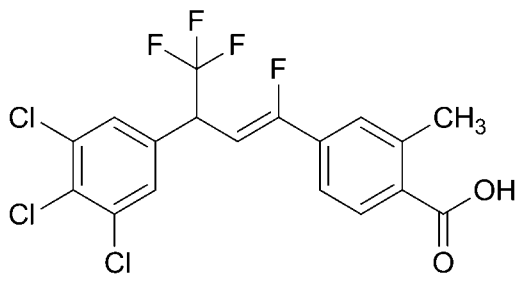
【0080】單離為棕色膠(2.0 g, 62%): ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 13.80 (br s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.09 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.93 - 7.78 (m, 4H), 6.91 (dd, $J = 35.7, 10.2$ Hz, 1H), 5.27 - 5.14 (m, 1H); IR(薄膜) 3081, 2927, 1714, 776 cm^{-1} ; ESIMS m/z 503 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

(Z)-4-(3-(3,4-二溴苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C13)



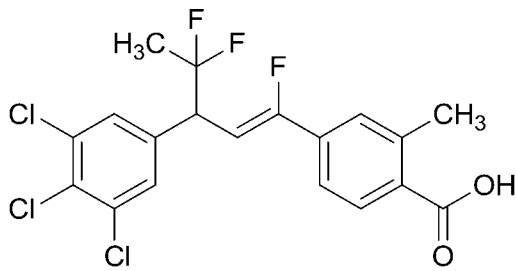
【0081】單離為黃色膠(2.1 g, 78%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.02 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.83 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.66 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.26 - 7.21 (m, 1H), 5.96 (dd, $J = 32.4, 9.2$ Hz, 1H), 4.67 - 4.58 (p, 1H); IR(薄膜) 3426, 2925, 1714, 1115 cm^{-1} ; ESIMS m/z 547 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

(Z)-2-甲基-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)苯甲酸(C14)



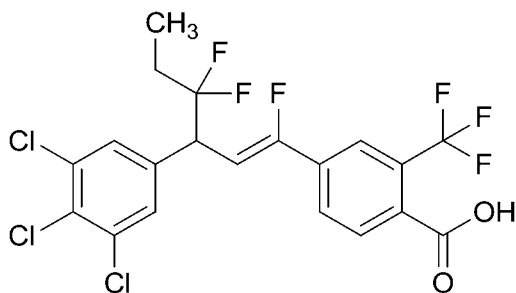
【0082】單離為橘色油(0.94 g，61%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.09 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H), 7.49 - 7.45 (m, 2H), 7.44 (s, 2H), 5.80 (dd, $J = 32.7, 9.6$ Hz, 1H), 4.60 (p, $J = 8.9$ Hz, 1H), 2.69 (s, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -69.40 (d, $J = 2.3$ Hz), -108.40 - -115.65 (m); ESIMS m/z 441 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

(Z)-2-甲基-4-(1,4,4-三氟-3-(3,4,5-三氯苯基)戊-1-烯-1-基)苯甲酸(C15)



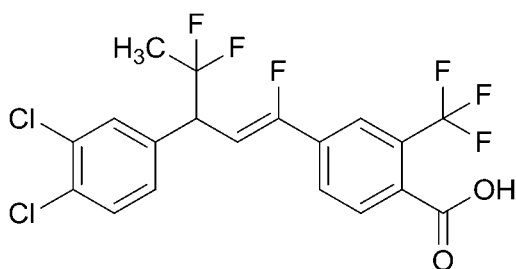
【0083】單離為橘色泡沫(0.204 g，51%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.07 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H), 7.49 - 7.40 (m, 4H), 5.86 (dd, $J = 33.9, 9.9$ Hz, 1H), 4.27 (td, $J = 14.3, 9.7$ Hz, 1H), 2.68 (s, 3H), 1.65 (t, $J = 18.4$ Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -95.11, -95.18, -114.57; ESIMS m/z 437 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

(Z)-4-(1,4,4-三氟-3-(3,4,5-三氯苯基)己-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C16)



【0084】單離為橘色泡沫(0.136 g , 63%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.99 (dd, $J = 8.4, 4.0$ Hz, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.80 (d, $J = 7.9$ Hz, 1H), 7.42 (d, $J = 2.6$ Hz, 2H), 6.08 - 5.87 (m, 1H), 4.32 (td, $J = 14.6, 9.8$ Hz, 1H), 1.87 (ddt, $J = 21.6, 15.4, 8.0$ Hz, 2H), 1.07 (t, $J = 7.4$ Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl_3) δ 170.72, 156.96 (d, $J_{\text{CF}} = 253.0$ Hz), 136.85, 135.06, 134.53, 133.75, 131.90, 131.19, 130.18, 129.17, 128.60, 128.05, 127.29, 124.11, 123.36 – 122.67 (m), 121.39, 104.66 (d, $J_{\text{CF}} = 18.0$ Hz), 46.46, 29.70 – 27.14 (m), 6.40 – 5.44 (m); ESIMS m/z 503 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

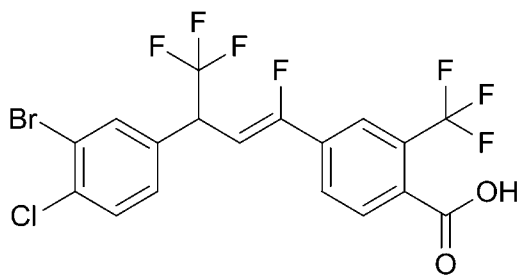
(Z)-4-(3-(3,4-二氯苯基)-1,4,4-三氟戊-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C17)



【0085】單離為橘色玻璃(0.495 g , 51%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.01 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H), 7.94 (d, $J = 1.6$ Hz, 1H), 7.80 (dd, $J = 8.2, 1.8$ Hz, 1H), 7.49 (d,

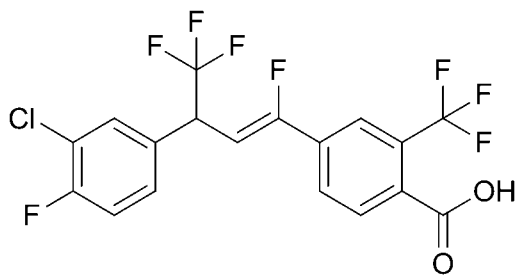
$J = 2.1$ Hz, 1H), 7.45 (d, $J = 8.3$ Hz, 1H), 7.26 7.22 (m, 1H), 6.00 (dd, $J = 33.9, 9.8$ Hz, 1H), 4.32 (ddd, $J = 15.8, 13.0, 9.8$ Hz, 1H), 1.62 (t, $J = 18.4$ Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -59.58, -89.79 – -99.81 (m), -115.63; IR(薄膜) 3008, 1711 cm^{-1} ; ESIMS m/z 455 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

(Z)-4-(3-(3,4-二氯苯基)-1,4,4-三氟戊-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C18)



【0086】單離為棕色膠(2.5 g, 46%): ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 13.79 (br s, 1H), 8.15 - 8.06 (m, 3H), 7.91 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.71 (s, 2H), 6.90 (dd, $J = 36.0, 10.2$ Hz, 1H), 5.21 - 5.15 (m, 1H); IR(薄膜) 3431, 2924, 1623, 597 cm^{-1} ; ESIMS m/z 503 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

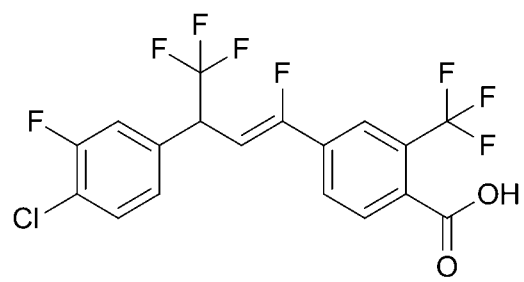
(Z)-4-(3-(3-氯-4-氟苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C19)



【0087】單離為黃色膠(1.50 g, 57%): ^1H NMR (300

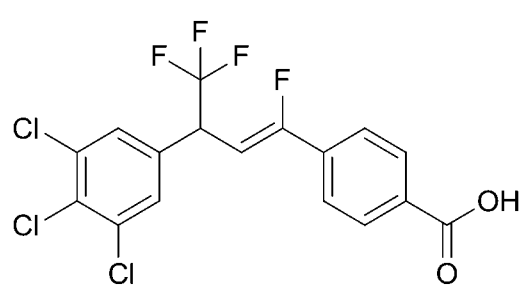
MHz, CDCl₃) δ 8.01 (d, *J* = 8.1 Hz, 2H) 7.94 (s, 2H), 7.76 - 7.75 (m, 1H), 7.37 (d, *J* = 6.0 Hz, 2H), 5.90 (dd, *J* = 32.1, 9.0 Hz, 1H); IR(薄膜) 3445, 2926, 1698, 1260, 750 cm⁻¹; ESIMS *m/z* 443 ([M-H]⁻)。

(*Z*)-4-(3-(4-氯-3-氟苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C20)



【0088】單離為棕色膠(0.50 g , 48%): ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 8.03 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.83 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 7.46 - 7.44 (m, 1H), 7.23 - 7.13 (m, 2H), 5.98 (dd, *J* = 34.2, 9.9 Hz, 1H), 4.69 - 4.63 (m, 1H); IR(薄膜) 3092, 1751, 750 cm⁻¹; ESIMS *m/z* 443 ([M-H]⁻)。

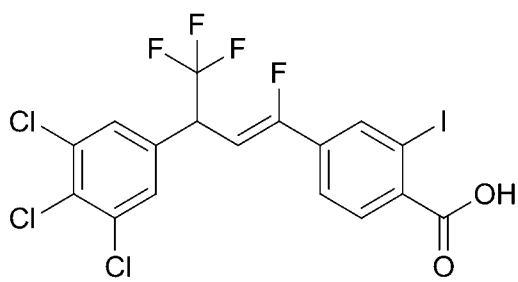
(*Z*)-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)苯甲酸(CC1)



【0089】單離為黃色膠(1.1 g , 56%): ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.15 (d, *J* = 8.2 Hz, 2H), 7.67 (d, *J* = 8.3

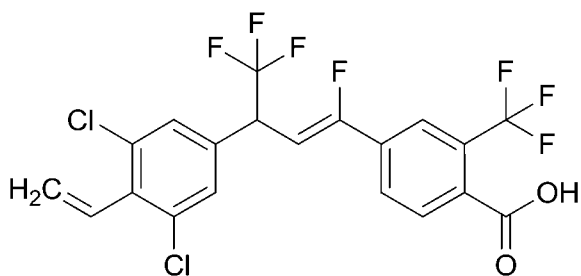
Hz, 2H), 7.44 (s, 2H), 5.84 (dd, $J = 32.6, 9.6$ Hz, 1H), 4.61 (p, $J = 8.9$ Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -69.38 (d, $J = 2.2$ Hz), -109.75 – -116.47 (m); ESIMS m/z 427 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

實施例2：(Z)-2-碘-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)苯甲酸(C21)之製備



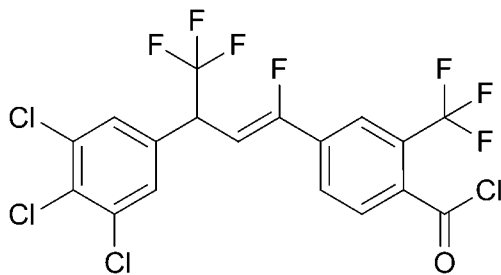
【0090】將(Z)-2-溴-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)苯甲酸(C1) (0.500 g, 0.987 mmol)、碘化銅(I) (0.00940 g, 0.0490 mmol)以及1,4-二噁烷(4.9 mL)添加至一個25 mL小瓶，以形成黃色懸浮液。添加碘化鈉(0.296 g, 1.97 mmol)及反式-*N,N'*-二甲環己烷-1,2-二胺(0.0140 g, 0.0990 mmol)，以及反應混合物係於110 °C下攪拌歷時3.5小時。濃縮反應混合物，以及藉由急速管柱層析法予以純化，以提供如棕色油之標題化合物(0.247 g, 43%): ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.21 (d, $J = 1.7$ Hz, 1H), 8.02 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H), 7.62 (dd, $J = 8.3, 1.7$ Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 5.82 (dd, $J = 32.5, 9.6$ Hz, 1H), 4.59 (p, $J = 8.9$ Hz, 1H); ^{19}F NMR (471 MHz, CDCl_3) δ -69.32, -112.14 (d, $J = 20.8$ Hz); ESIMS m/z 553($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

實施例3：(Z)-2-碘三氟甲基-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)苯甲酸(C22)之製備



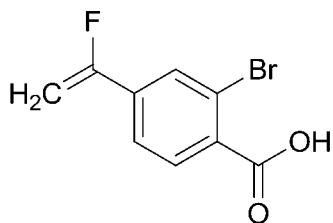
【0091】於室溫下將四(三苯基膦)鈀(0)(0.30 g, 0.26 mmol)添加至配於甲苯(10 mL)之(Z)-4-(3-(4-溴-3,5-二氯苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C11)(1.4 g, 2.6 mmol)的溶液內。反應混合物係用氮(3 x 10分鐘)清洗予以除氣。添加三丁基乙基錫烷(0.82 g, 2.6 mmol)至反應混合物。反應混合物再次用氮(3 x 10分鐘)清洗予以除氣，以及於120℃下攪拌3小時。反應混合物係用水來驟冷，然後用乙酸乙酯來萃取。有機層係於硫酸鈉上乾燥、過濾以及濃縮。藉由使用30%乙酸乙酯/己烷之急速管柱層析法予以純化，提供如淡黃色膠之標題化合物(0.80 g, 63%): ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 7.85 (s, 1H), 7.82 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.74 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.37 (s, 1H), 6.72 - 6.65 (dd, $J = 17.6$ Hz, 11.6 Hz, 1H), 5.86 - 5.73 (m, 3H), 4.61 - 4.56 (m, 1H); IR(薄膜) 3445, 2925, 1646, 1275, 749 cm^{-1} ; ESIMS m/z 488 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)。

實施例4：(Z)-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯氯(C23)之製備



【0092】將配於二氯甲烷(1.3 mL)之(*Z*)-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(**C2**) (0.200 g, 0.404 mmol)、草醯氯(0.095 mL, 1.09 mmol)及*N,N*-二甲基甲醯胺(催化量)添加至一個25 mL小瓶，以提供黃色溶液。反應係於室溫下攪拌歷時15小時。於真空下移除溶劑提供如黃色膠之標題化合物 0.220 g, 95%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.99 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.81 (dd, J = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 5.88 (dd, J = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 4.73 - 4.50 (m, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -59.58, -69.32, -109.75 - -113.19 (m); IR(薄膜) 3445, 2925, 1646, 1275, 749 cm^{-1} ; ESIMS m/z 476 ($[\text{M}-\text{Cl}]^+$)。

實施例5：2-溴-4-(1-氟乙烯基)苯甲酸(**C24**)之製備

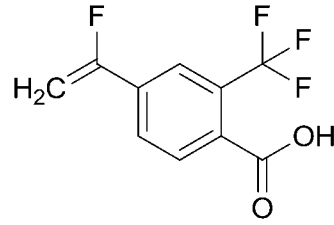


【0093】將甲基 2-溴-4-(1-氟乙烯基)苯甲酸酯(**C29**) (1.8 g, 7.0 mmol)、氫氧化鋰水合物(0.88 g, 21 mmol)、甲醇(7.0 mL)、四氫呋喃(21mL)，以及水(7.0 mL)添加至一個250 mL圓底燒瓶，以及反應混合物係室溫下攪拌過

夜。使混合物濃縮，以及以pH 4的緩衝液來驟冷，並且用乙酸乙酯來萃取，以提供如白色固體之標題化合物(1.0 g，56%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.01 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H), 7.89 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.57 (dd, $J = 8.3, 1.8$ Hz, 1H), 5.21 (dd, $J = 48.6, 4.0$ Hz, 1H), 5.06 (dd, $J = 17.3, 3.9$ Hz, 1H); ^{19}F NMR (471 MHz, CDCl_3) δ -108.71 (d, $J = 1.4$ Hz); ESIMS m/z 244 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

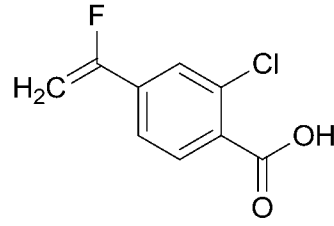
【0094】 下列化合物係以實施例5中概述之流程相似的方式予以製備：

4-(1-氟乙基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C25)



【0095】 單離為白色固體(1.9 g，93%): ^1H NMR (400 MHz, 甲醇- d_4) δ 7.95 (d, $J = 1.5$ Hz, 1H), 7.95 - 7.91 (m, 1H), 7.90 - 7.86 (m, 1H), 5.46 (dd, $J = 50.0, 4.1$ Hz, 1H), 5.09 (dd, $J = 18.0, 4.1$ Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, 甲醇- d_4) δ -61.04 (d, $J = 1.1$ Hz), -110.93; ESIMS m/z 233 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

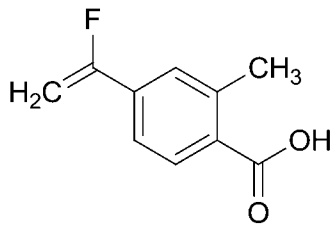
2-氯-4-(1-氟乙基)苯甲酸(C26)



【0096】 單離為白色固體(3.5 g，75%): ^1H NMR

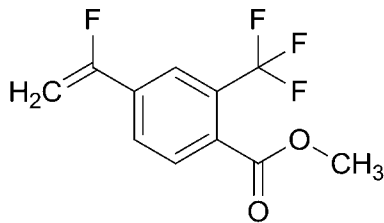
(400 MHz, 丙酮- d_6) δ 7.97 (dd, $J = 8.2, 0.9$ Hz, 1H), 7.76 (d, $J = 1.7$ Hz, 1H), 7.70 (dd, $J = 8.2, 1.7$ Hz, 1H), 5.68 - 5.45 (m, 1H), 5.11 (dd, $J = 18.2, 4.1$ Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, 丙酮- d_6) δ -108.71; ESIMS m/z 200 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

4-(1-氟乙基)-2-甲基苯甲酸(C27)



【0097】單離為白色固體(0.550 g, 89%): ^1H NMR (400 MHz, 甲醇- d_4) δ 7.92 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.59 - 7.52 (m, 1H), 7.52 - 7.44 (m, 1H), 5.29 (dd, $J = 50.1, 3.7$ Hz, 1H), 4.93 (dd, $J = 18.1, 3.7$ Hz, 1H), 2.60 (s, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, 甲醇- d_4) δ -110.32 (d, $J = 2.1$ Hz); ESIMS m/z 181 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)。

實施例6：甲基 4-(1-氟乙基)-2-(三氟甲基)苯甲酸酯 (C28)之製備

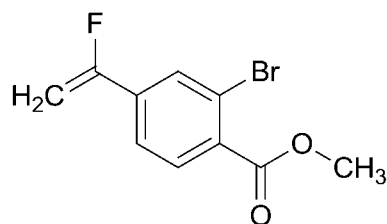


【0098】將甲基 4-溴-2-(三氟甲基)苯甲酸酯(2.25 g, 8.00 mmol)、(1-氟乙基)(甲基)二苯基矽烷(3.58 g, 14.8 mmol)及1,3-二甲咪唑啉-2-酮(40 mL)添加至一個 100 mL 圓底燒瓶。添加四(三苯基膦)鈦(0) (0.459 g, 0.400

mmol)、碘化銅(I) (0.0760 mg, 0.400 mmol)及氟化鉀 (3.62 g, 23.9 mmol), 以及反應係於氮氣氛圍下、在室溫下攪拌歷時24小時。將水添加至混合物且混合物用3:1己烷/二乙基醚來稀釋。使層分離, 以及有機層係於硫酸鈉上乾燥、濃縮, 以及殘餘物係藉由急速管柱層析法予以純化, 以提供如無色油之標題化合物(2.00 g, 96%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.96 - 7.87 (m, 1H), 7.83 (dq, J = 8.1, 0.7 Hz, 1H), 7.77 (dd, J = 8.2, 1.7 Hz, 1H), 5.23 (dd, J = 48.6, 4.0 Hz, 1H), 5.07 (dd, J = 17.4, 4.0 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -59.92, -108.73 (d, J = 1.4 Hz); EIMS m/z 248 ($[\text{M}]^+$)。

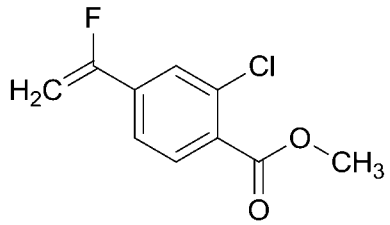
【0099】 下列化合物係以實施例6中概述之流程相似的方式予以製備：

甲基 2-溴-4-(1-氟乙基)苯甲酸酯(C29)



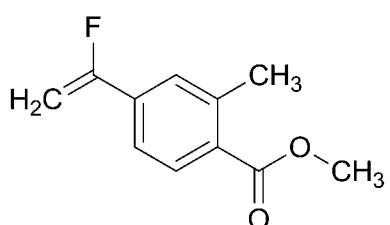
【0100】 單離為無色油(1.8 g, 93%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.84 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.82 (dd, J = 8.2, 0.9 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 5.16 (dd, J = 48.7, 3.9 Hz, 1H), 5.01 (dd, J = 17.3, 3.9 Hz, 1H), 3.94 (d, J = 2.2 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -108.61 (d, J = 1.5 Hz); ESIMS m/z 258 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

甲基 2-氯-4-(1-氟乙基)苯甲酸酯(C30)



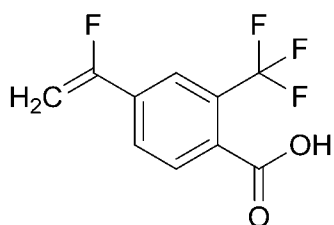
【0101】單離為無色油(2.1 g , 99%): ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 7.86 (dd, *J* = 8.2, 0.9 Hz, 1H), 7.64 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.48 (dd, *J* = 8.3, 1.8 Hz, 1H), 5.17 (dd, *J* = 48.7, 3.8 Hz, 1H), 5.02 (dd, *J* = 17.3, 3.9 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H); ¹⁹F NMR (376 MHz, CDCl₃) δ -108.63 (d, *J* = 1.4 Hz); ESIMS *m/z* 214 ([M-H]⁻)。

甲基 2-氯-4-(1-氟乙烯基)苯甲酸酯(C31)



【0102】單離為無色油(0.5 g , 85%): ¹H NMR (400 MHz, 甲醇-*d*₄) δ 7.90 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.49 (dd, *J* = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 5.30 (dd, *J* = 50.1, 3.7 Hz, 1H), 4.95 (dd, *J* = 18.0, 3.7 Hz, 1H), 3.88 (d, *J* = 5.9 Hz, 3H), 2.59 (s, 3H); ¹⁹F NMR (376 MHz, 甲醇-*d*₄) δ -110.41 (d, *J* = 1.3 Hz); ESIMS *m/z* 195 ([M+H]⁺)。

實施例7：4-(1-氟乙烯基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C25)之製備

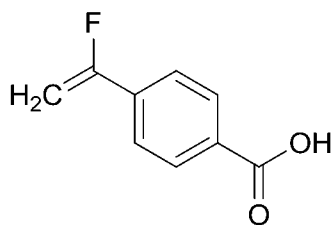


【0103】步驟1：4-(2-溴-1-氟乙基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C32) 使2-(三氟甲基)-4-乙烯基苯甲酸(5.3 g, 24 mmol)於0℃下溶解於二氯甲烷(123 mL)內，添加三乙胺三氟化氫(8.0 mL, 49 mmol)接著*N*-溴琥珀醯亞胺(8.7 g, 49 mmol)。反應混合物攪拌歷時16小時同時加溫至室溫。繼而將水添加至混合物，用二氯甲烷來清洗，於硫酸鈉上乾燥、過濾以及濃縮，提供如黃色油之標題化合物，其能未經進一步純化即使用(5.0 g, 65%)。

【0104】步驟2：4-(1-氟乙烯基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C25) 使4-(2-溴-1-氟乙基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(4.3 g, 14 mmol)於0℃下溶解於甲醇(68 mL)之內，以及添加固體的第三丁氧基鉀(4.6 g, 41 mmol)同時攪拌。允許反應混合物緩慢地加溫至23 °C，然後攪拌歷時4小時。緩慢地添加鹽酸(1 N)，以及混合物係用乙酸乙酯來萃取。藉由使用0-40%丙酮/己烷之急速管柱層析法予以純化，提供如灰白色固體之標題化合物(1.7 g, 53%): ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.02 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 8.00 - 7.93 (m, 1H), 7.82 (dd, *J* = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 5.27 (dd, *J* = 48.5, 4.1 Hz, 1H), 5.11 (dd, *J* = 17.3, 4.1 Hz, 1H)。

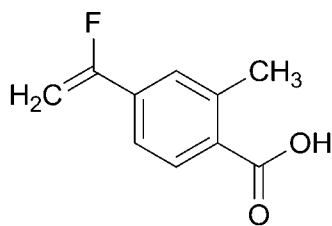
【0105】下列化合物係以實施例7中概述之流程相似的方式予以製備：

4-(1-氟乙烯基)苯甲酸(C33)



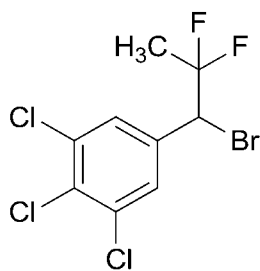
【0106】單離為白色固體(6.5 g , 86%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.13 (d, $J = 8.2$ Hz, 2H), 7.69 - 7.62 (m, 2H), 5.21 (dd, $J = 49.0, 3.7$ Hz, 1H), 5.02 (dd, $J = 17.5, 3.7$ Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -108.35; ESIMS m/z 165 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

4-(1-氟乙烯基)-2-甲基苯甲酸(C27)



【0107】單離為無色油(0.165 g , 89%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.12 - 8.03 (m, 1H), 7.46 (dd, $J = 5.8, 2.1$ Hz, 2H), 5.17 (dd, $J = 49.1, 3.7$ Hz, 1H), 4.98 (dd, $J = 17.5, 3.7$ Hz, 1H), 2.68 (s, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -108.50。

實施例8：5-(1-溴-2,2-二氟丙基)-1,2,3-三氯苯(C34)之製備之製備

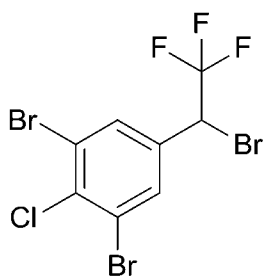


【0108】將N-溴琥珀醯亞胺(12.0 g , 67.5 mmol)添

加至配於二氯甲烷(72.6 mL)之2,2-二氟-1-(3,4,5-三氟苯基)丙-1-醇(**C43**)(6.00 g, 21.8 mmol)溶液內。緩慢逐滴地添加亞磷酸三苯酯(17.1 mL, 65.3 mmol)至此攪拌溶液，以及反應混合物變成棕黑色。反應混合物繼而以回流加熱歷時3小時。使溶劑濃縮，以及殘餘物係以二乙基醚予以研磨。將固體過濾，濃縮濾液，以及生成的油藉由使用己烷作為溶析液之急速管柱層析法予以純化，以提供如澄清且無色油之標題化合物 (2.20 g, 25%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.52 (s, 2H), 4.85 (dd, $J = 12.3, 10.4$ Hz, 1H), 1.77 (t, $J = 18.2$ Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -92.14 – -95.01 (m); EIMS m/z 338 ($[\text{M}]^+$)。

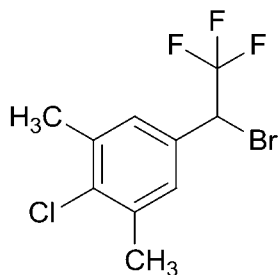
【0109】 下列化合物係以實施例8中概述之流程相似的方式予以製備：

1,3-二溴-5-(1-溴-2,2,2-三氟乙基)-2-氯苯(C35)



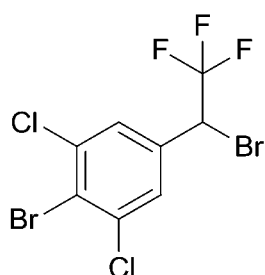
【0110】 單離為澄清油(28 g, 56%): ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8.01 - 7.97 (m, 2H), 6.26 - 6.20 (m, 1H); IR(薄膜) 1168, 736, 557 cm^{-1} ; ESIMS m/z 428 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)。

5-(1-溴-2,2,2-三氟乙基)-2-氯-1,3-二甲苯(C36)



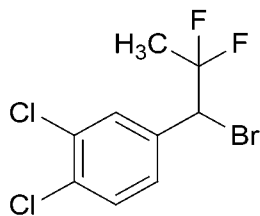
【0111】單離為澄清油(6.32 g, 89%): ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 7.39 (s, 2H), 6.17-6.09 (m, 1H), 2.35 (s, 6H); IR(薄膜) 1114, 754 cm^{-1} ; ESIMS m/z 302 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)。

2-溴-5-(1-溴-2,2,2-三氟乙基)-1,3-二氯苯(C37)



【0112】單離為澄清油(19 g, 46%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.54 - 7.51 (m, 2H), 5.03 - 4.98 (m, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ - 70.38。

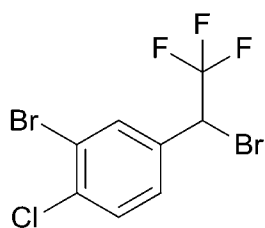
4-(1-溴-2,2-二氟丙基)-1,2-二氯苯(C38)



【0113】單離為無色液體(1.40 g, 65%): ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 7.76 - 7.70 (m, 2H), 7.54 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 5.81 - 5.73 (m, 1H), 1.67 (d, J = 18.9 Hz, 3H); IR(薄膜) 1118, 800, 499 cm^{-1} ; EIMS m/z 304

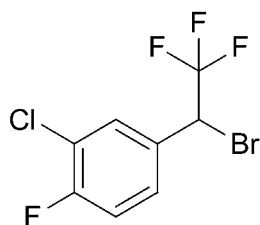
($[M]^+$)。

2-溴-4-(1-溴-2,2,2-三氟乙基)-1-氯苯(C39)



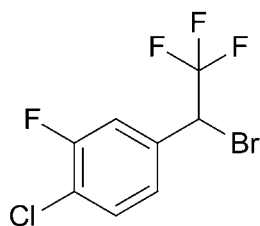
【0114】單離為無色液體(10.5 g, 54%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.76 (d, $J = 1.2$ Hz, 1H), 7.49 - 7.47 (m, 1H), 7.41 - 7.39 (m, 1H), 5.07 - 5.02 (m, 1H); IR(薄膜) 3437, 2924, 1631, 1114 cm^{-1} ; EIMS m/z 350 ($[M]^+$)。

4-(1-溴-2,2,2-三氟乙基)-2-氯-1-氟苯(C40)



【0115】單離為無色油(8.0 g, 73%): ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 7.59 - 7.57 (m, 1H), 7.42 - 7.33 (m, 1H), 7.20 - 7.14 (m, 1H), 5.10 - 5.03 (m, 1H); IR(薄膜) 3429, 2926, 1502, 750 cm^{-1} ; ESIMS m/z 292 ($[M+H]^+$)。

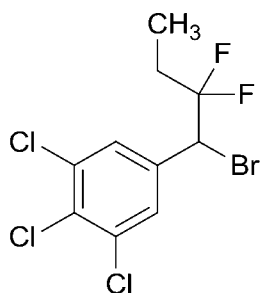
4-(1-溴-2,2,2-三氟乙基)-1-氯-2-氟苯(C41)



【0116】單離為黃色油(1.1 g, 45%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.44 (dd, $J = 8.3, 7.5$ Hz, 1H), 7.34 (dd, $J = 9.5, 1.9$ Hz, 1H), 7.26 - 7.22 (m, 1H), 5.08 (q, $J =$

7.1 Hz, 1H); EIMS m/z 291 ($[M]^+$)。

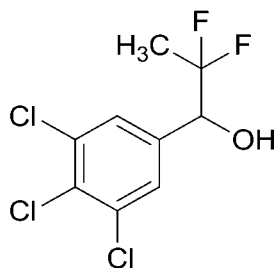
實施例9：5-(1-溴-2,2-二氟丁基)-1,2,3-三氯苯(C42)之製備



【0117】將三乙胺(2.46 mL, 17.6 mmol)及甲磺醯氯(1.10 mL, 14.1 mmol)添加至配於二氯甲烷(58.7 mL)之2,2-二氟-1-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-醇(C44) (3.40 g, 11.7 mmol)之溶液內。反應混合物攪拌歷時1小時，然後添加戊烷。過濾接著於真空下濃縮濾液提供白色固體。使固體溶解於二氯甲烷(58.7 mL)內以及添加溴化鐵(III) (6.94 g, 23.5 mmol)至其內。使反應混合物攪拌過夜。將混合物傾注至水內，然後用二氯甲烷來萃取。有機物係用鹽水清洗，於硫酸鈉上乾燥、過濾以及濃縮。藉由使用己烷作為溶析液之急速管柱層析法予以純化提供如白色固體之標題化合物(3.52 g, 72%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.51 (s, 2H), 4.85 (t, $J = 12.1$ Hz, 1H), 2.14 - 1.91 (m, 2H), 1.06 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl_3) δ 135.55, 134.39, 132.52, 129.48, 120.25 (t, $J = 249.0$ Hz), 49.76 (t, $J = 30.3$ Hz), 28.03 (t, $J = 25.2$ Hz), 6.06 (t, $J = 5.1$ Hz); ESIMS m/z 351 ($[M-H]^-$)。

實施例10：2,2-二氟-1-(3,4,5-三氯苯基)丙-1-醇(C43)之

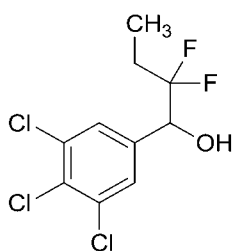
製備



【0118】於室溫下，使2,2-二氟-1-(3,4,5-三氯苯基)丙-1-酮(**C52**) (1.75 g, 6.40 mmol)溶解於甲醇(64.0 mL)之內，以及添加硼氫化鈉(0.290 g, 7.68 mmol)。反應係於室溫下攪拌歷時1小時，直到氣體散展為止。將反應混合物傾注至水內以及用二乙基醚來萃取。有機層係用鹽水清洗，於硫酸鈉上乾燥、過濾以及濃縮。藉由使用0-30%丙酮/己烷作為溶析液之急速管柱層析法予以純化，提供如澄清、無色油之標題化合物(1.60 g, 91%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.50 (d, $J = 0.9$ Hz, 2H), 4.81 (td, $J = 8.7, 3.8$ Hz, 1H), 1.65 – 1.41 (m, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -98.54 – -101.73 (m); IR(薄膜) 3405, 1555, 1389 cm^{-1} 。

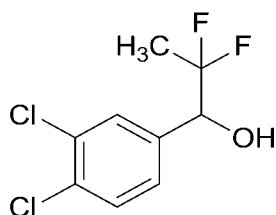
【0119】下列化合物係以實施例10中概述之流程相似的方式予以製備：

2,2-二氟-1-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-醇(C44)



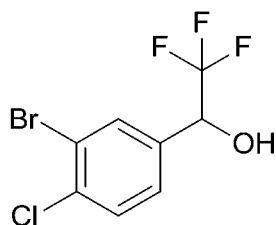
【0120】單離為澄清及無色油(3.4 g, 48%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.48 (d, $J = 0.9$ Hz, 2H), 4.87 - 4.70 (m, 1H), 2.54 (dt, $J = 4.0, 1.0$ Hz, 1H), 2.06 - 1.82 (m, 1H), 1.82 - 1.63 (m, 1H), 1.02 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl_3) δ 136.85, 134.20, 131.60, 127.54, 123.19 (t, $J = 248.0$ Hz), 73.71 (t, $J = 30.0$ Hz), 25.05 (t, $J = 24.6$ Hz), 5.35 (t, $J = 5.2$ Hz); EIMS m/z 287 ($[\text{M}]^+$)。

1-(3,4-二氯苯基)-2,2-二氟丙-1-醇(C45)



【0121】單離為澄清及無色油(2.78 g, 89%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.57 (dd, $J = 2.0, 0.9$ Hz, 1H), 7.46 (d, $J = 8.3$ Hz, 1H), 7.33 - 7.27 (m, 1H), 4.83 (td, $J = 8.9, 3.7$ Hz, 1H), 2.55 (dt, $J = 3.8, 1.1$ Hz, 1H), 1.50 (t, $J = 18.9$ Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -99.52 (d, $J = 249.6$ Hz), -101.09 (d, $J = 249.4$ Hz); IR(薄膜) 3417 cm^{-1} 。

實施例11：1-(3-溴-4-氯苯基)-2,2,2-三氟乙醇(C46)之製備

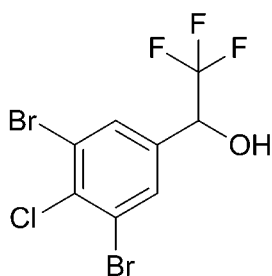


【0122】於室溫下將三甲基(三氟甲基)矽烷(10.1 mL, 68.4 mmol)及四丁基氟化銨(1.44 g, 4.56 mmol)添加至配於四氫呋喃(150 mL)之3-溴-4-氯-苯甲醛(10.0 g, 45.6 mmol)之攪拌溶液內, 以及反應混合物攪拌歷時2小時。反應混合物係用二氯甲烷予以稀釋且用鹽酸(2 N)來清洗。分離的有機層係用鹽水來清洗, 於硫酸鈉上乾燥、過濾以及濃縮, 以提供如棕色液體之標題化合物, 其能未經進一步純化即使用(13.2 g, 94%):

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 7.76 (s, 1H), 7.50 - 7.48 (m, 1H), 7.38 - 7.35 (m, 1H), 5.03 - 4.97 (m, 1H), 2.95 (br s, 1H); IR(薄膜) 3406, 2881, 1469, 814 cm^{-1} ; EIMS m/z 288 ($[\text{M}]^+$)。

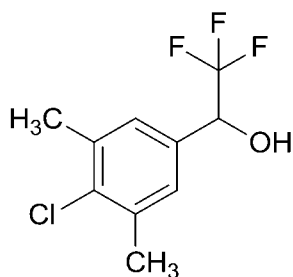
【0123】下列化合物係以實施例11中概述之流程相似的方式予以製備:

1-(3,5-二溴-4-氯苯基)-2,2,2-三氟乙醇(C47)



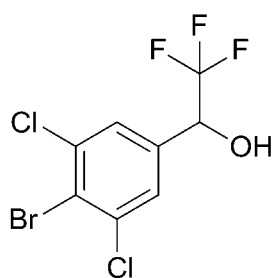
【0124】單離為淡黃色液體(7.4 g, 85%): ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 7.90 (s, 2H), 7.24 (d, $J = 5.2$ Hz, 1H), 5.33 (d, $J = 6.4$ Hz, 1H); IR(薄膜) 3370, 1175, 735, 541 cm^{-1} ; EIMS m/z 366 ($[\text{M}]^+$)。

1-(4-氯-3,5-二甲基苯基)-2,2,2-三氟乙醇(C48)



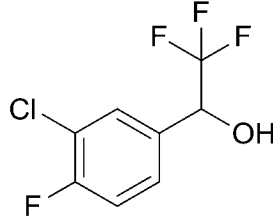
【0125】單離為澄清液體(5.0 g，70%)：¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 7.18 (s, 2H), 4.95 - 4.92 (m, 1H), 2.40 (s, 6H); IR(薄膜) 3378, 1124, 833 cm⁻¹; EIMS *m/z* 238 ([M]⁺)。

1-(4-溴-3,5-二氯苯基)-2,2,2-三氟乙醇(C49)



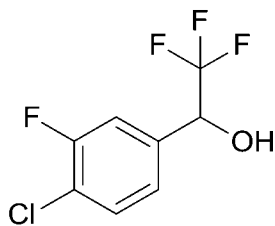
【0126】單離為澄清油(33 g，86%)：¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 7.51 (s, 2H), 5.01 - 4.96 (m, 1H), 4.14 - 4.09 (m, 1H); ¹⁹F NMR (376 MHz, CDCl₃) δ -78.32。

1-(3-氯-4-氟苯基)-2,2,2-三氟乙醇(C50)



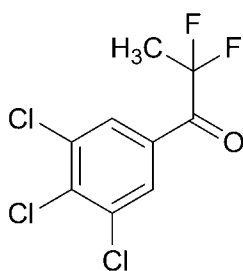
【0127】單離為澄清及棕色膠(7.0 g，97%)：¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 7.58 - 7.55 (m, 1H), 7.38 - 7.33 (m, 1H), 7.20 - 7.15 (m, 1H), 5.03 - 4.97 (m, 1H); EIMS *m/z* 228 ([M]⁺)。

1-(4-氯-3-氟苯基)-2,2,2-三氟乙醇(C51)



【0128】單離為澄清及無色油(1.97 g, 75%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.52 - 7.37 (m, 1H), 7.32 (d, $J = 9.6$ Hz, 1H), 7.21 (d, $J = 8.3$ Hz, 1H), 5.03 (dd, $J = 6.3, 3.6$ Hz, 1H), 2.62 (d, $J = 4.0$ Hz, 1H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl_3) δ 158.06 ($J_{\text{CF}} = 188.9$ Hz), 134.40 (d, $J_{\text{CF}} = 6.6$ Hz), 130.79, 123.83 (d, $J_{\text{CF}} = 3.5$ Hz), 122.4 (q, $J_{\text{CF}} = 188.9$ Hz), 115.8 (d, $J = 25.3$ Hz), 71.65 (q, $J_{\text{CF}} = 31.6$ Hz); EIMS m/z 228 ($[\text{M}]^+$)。

實施例12：2,2-二氟-1-(3,4,5-三氯苯基)丙-1-酮(C52)之製備

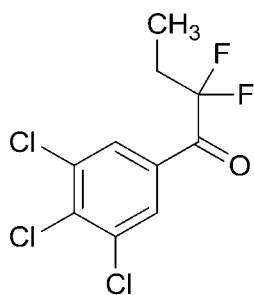


【0129】於氮氣下，在 -78°C 將正丁基鋰(3.50 mL, 8.76 mmol)添加至溶解於二乙基醚(39.8 mL)內之5-溴-1,2,3-三氯苯(2.28 g, 8.76 mmol)。使溶液攪拌30分鐘。於10分鐘內逐滴地添加2,2-二氟化丙酸乙酯(1.10 g, 7.96 mmol, 為配於甲苯之20% w/w溶液)至此，以及反應混合物攪拌額外的1小時。添加飽和的含水氯化銨溶液至混合

物，以及於反應燒瓶加溫至室溫時持續攪拌。反應混合物接而用二乙基醚來萃取，用水及鹽水清洗，於硫酸鈉上乾燥、過濾以及濃縮。藉由急速管柱層析法予以純化，提供如淡黃色油之標題化合物(1.76 g, 73%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.11 (d, $J = 0.9$ Hz, 2H), 1.89 (t, $J = 19.6$ Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -92.66; ESIMS m/z 271 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

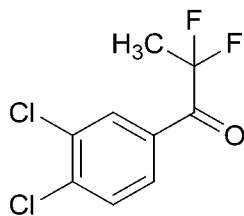
【0130】 下列化合物係以實施例12中概述之流程相似的方式予以製備：

2,2-二氟-1-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-酮(C53)



【0131】 單離為油(2.3 g, 68%)且可不需純化或特徵化即使用。

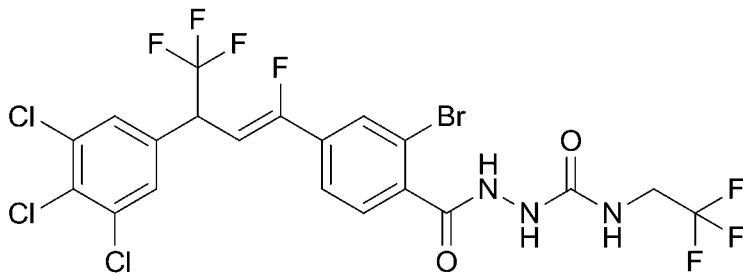
1-(3,4-二氯苯基)-2,2-二氟丙-1-酮(C54)



【0132】 單離為無色油(3.89 g, 71%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.21 - 8.18 (m, 1H), 7.99 - 7.93 (m, 1H), 7.59 (dd, $J = 8.4, 4.2$ Hz, 1H), 1.89 (t, $J = 19.6$ Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -92.08 -- -93.21 (m); EIMS

m/z 238/240 ($[M]^+$)。

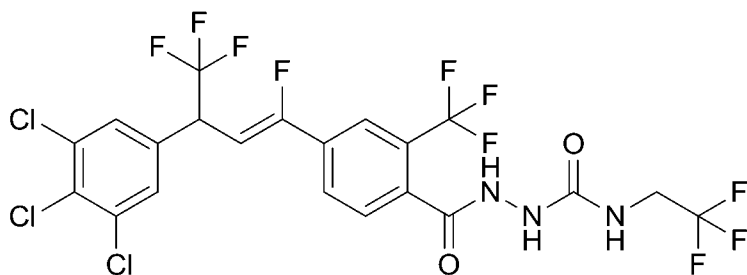
實施例13：(Z)-2-(2-溴-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)苯甲醯基)-N-(2,2,2-三氟乙基)肼甲醯胺(F2)之製備



【0133】將配於二氯甲烷 (2.6 mL) 之 (Z)-2- 溴-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)苯甲酸(C1) (0.066 g, 0.13 mmol)、N-(2,2,2-三氟乙基)肼甲醯胺鹽酸鹽 (0.038 g, 0.20 mmol) 以及 ((1*H*- 苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)氧)三(吡咯啉-1-基)磷六氟磷酸酯 (V) (0.10 g, 0.20 mmol) 添加至一個25 mL小瓶，以提供橘色懸浮液。添加三乙胺(0.073 mL, 0.52 mmol)且使反應混合物於室溫下攪拌過夜。使溶劑濃縮，以及殘餘物係藉由急速管柱層析法予以純化，以提供如白色膠之標題化合物(0.013 g, 13%)。

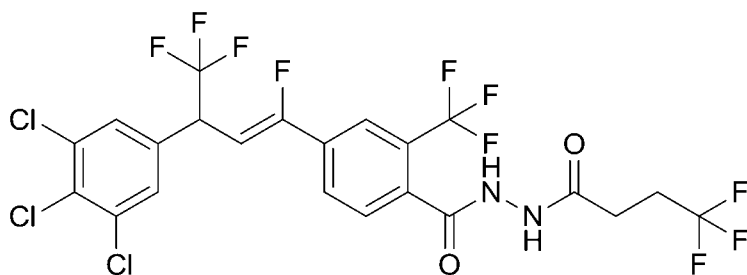
【0134】下列化合物係以實施例13中概述之流程相似的方式予以製備：

(Z)-2-(4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)-N-(2,2,2-三氟乙基)肼甲醯胺(F3)



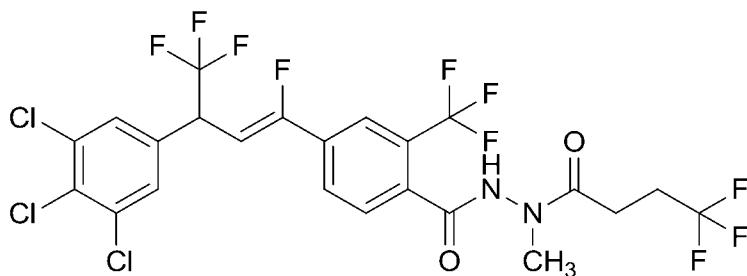
【0135】單離為黃色油(0.02 g，30%)。

(Z)-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-N'-(4,4,4-三氟丁基)-2-(三氟甲基)苯甲醯肼(F4)



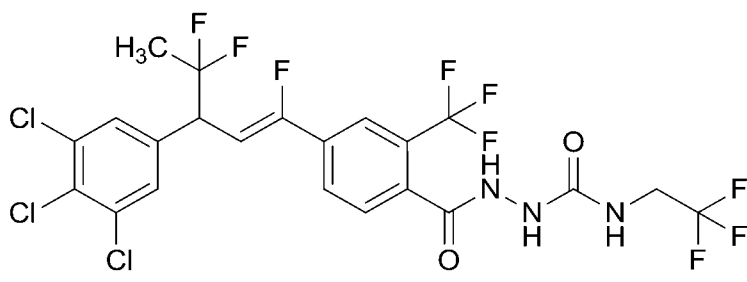
【0136】單離為黃色油(0.101 g，75%)。

(Z)-N'-甲基-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-N'-(4,4,4-三氟丁基)-2-(三氟甲基)苯甲醯肼(F11)



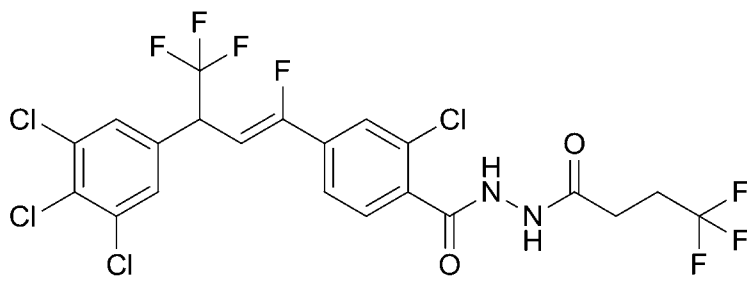
【0137】單離為無色膠(0.055 g，38%)。

(Z)-2-(4-(1,4,4-三氟-3-(3,4,5-三氯苯基)戊-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)-N-(2,2,2-三氟乙基)肼甲醯胺(F12)



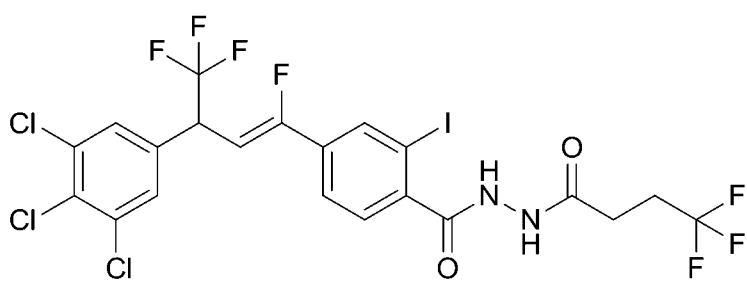
【0138】單離為無色膠(0.027 g，42%)。

(Z)-2-氯-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-N'-(4,4,4-三氟丁醯基)苯甲醯肼(F20)



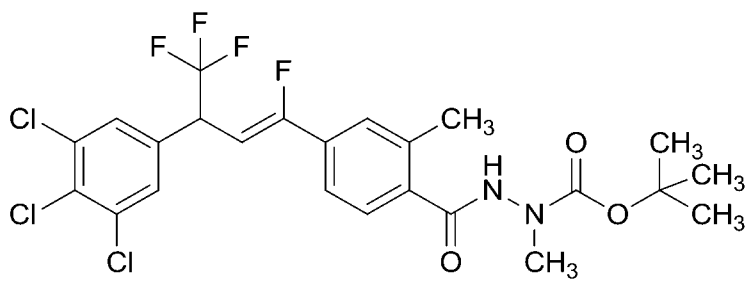
【0139】單離為無色膠(0.072 g，66%)。

(Z)-2-碘-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-N'-(4,4,4-三氟丁醯基)苯甲醯肼(F21)



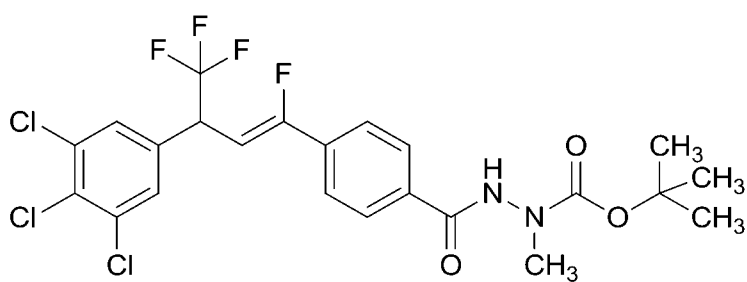
【0140】單離為黃色膠(0.070 g，67%)。

(Z)-三級丁基 1-甲基-2-(2-甲基-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)苯甲醯基)肼甲酸酯(C55)



【0141】單離為黃色油(0.160 g , 74%): ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.28 (s, 1H), 7.61 - 7.54 (m, 1H), 7.49 - 7.35 (m, 4H), 5.74 (dd, *J* = 32.9, 9.6 Hz, 1H), 4.60 (p, *J* = 9.0 Hz, 1H), 3.23 (s, 3H), 2.50 (s, 3H), 1.47 (s, 9H); ¹⁹F NMR (376 MHz, CDCl₃) δ -69.47 (d, *J* = 2.1 Hz), -111.63; EISIMS *m/z* 567 ([M-H]⁻)。

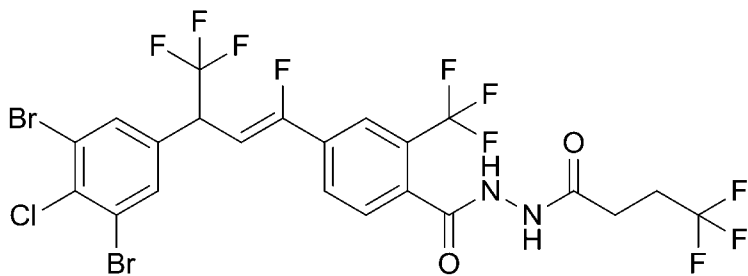
(Z)-三級丁基 1-甲基-2-(4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)苯甲醯基)肼甲酸酯(CC2)



【0142】單離為白色膠(0.088 g , 87%): ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.96 (s, 1H), 7.80 (d, *J* = 8.0 Hz, 2H), 7.42 (d, *J* = 6.4 Hz, 4H), 5.74 (d, *J* = 32.6 Hz, 1H), 4.59 (p, *J* = 8.6 Hz, 1H), 3.23 (d, *J* = 6.3 Hz, 3H), 1.48 (s, 9H); ¹⁹F NMR (376 MHz, CDCl₃) δ -69.42 (d, *J* = 5.9 Hz), -111.62 (d, *J* = 40.7 Hz); ESIMS *m/z* 555 ([M-H]⁻)。

實施例14: (Z)-4-(3-(3,5-二溴-4-氯苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-N'-(4,4,4-三氟丁醯基)-2-(三氟甲基)苯甲醯

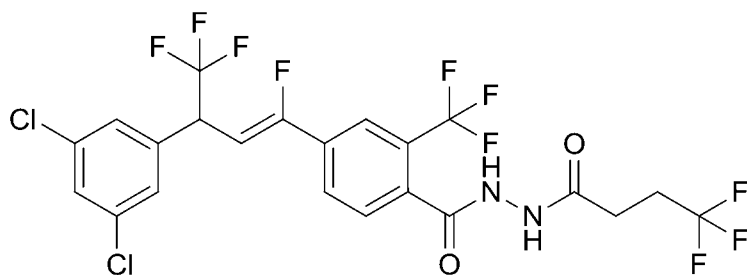
肼(F5)之製備



【0143】將二異丙基乙胺(0.18 mL，1.0 mmol)、2-氯-1,3-二甲基咪唑六氟磷酸酯(2-Chloro-1,3-dimethylimidazolidinium hexafluorophosphate)(0.095 g，0.34 mmol)、3*H*-[1,2,3]三唑并[4,5-*b*]吡啶-3-醇(0.046 g，0.34 mmol)及4,4,4-三氟丁烷肼鹽酸鹽(0.072 g，0.38 mmol)添加至配於二氯甲烷(5 mL)之(*Z*)-4-(3-(3,5-二溴-4-氯苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(**C5**) (0.20 g，0.34 mmol)攪拌溶液，以及使反應混合物於室溫下攪拌歷時6小時。將反應混合物傾注至水內，以及用二氯甲烷來萃取。分離的有機層係用水、鹽水清洗，於硫酸鈉上乾燥、過濾以及濃縮。藉由使用30%乙酸乙酯/石油醚作為溶析液之急速管柱層析法予以純化，提供如棕色固體之標題化合物(0.11 g，39%)。

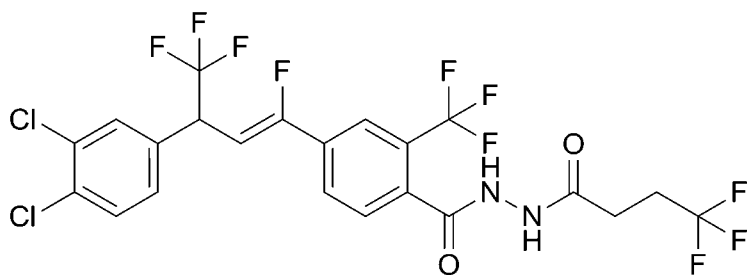
【0144】下列化合物係以實施例14中概述之流程相似的方式予以製備：

(*Z*)-4-(3-(3,5-二氯苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-*N'*-(4,4,4-三氟丁基)-2-(三氟甲基)苯甲酰肼(**F6**)



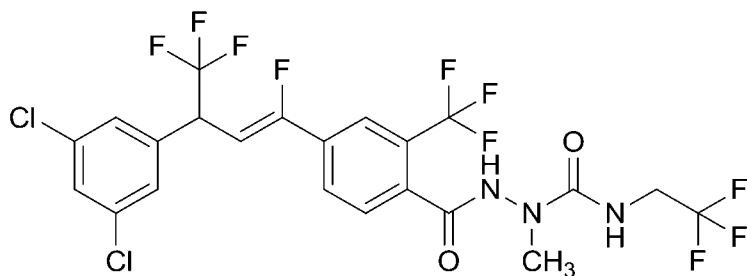
【0145】單離為淺黃色固體(0.120 g，42%)。

(Z)-4-(3-(3,4- 二 氯 苯 基)-1,4,4,4- 四 氟 丁 -1- 烯 -1-
基)-N'-(4,4,4-三氟丁基)-2-(三氟甲基)苯甲醯肼(F7)



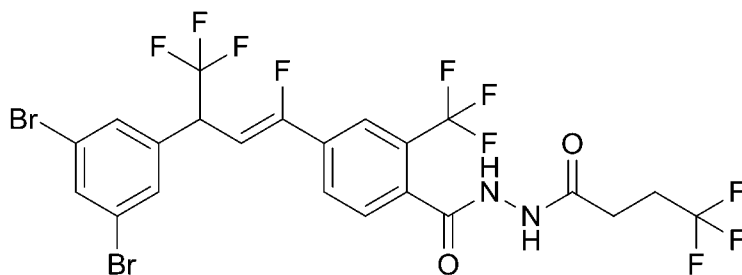
【0146】單離為淺黃色固體 (0.100 g，41%)。

(Z)-2-(4-(3-(3,5- 二 氯 苯 基)-1,4,4,4- 四 氟 丁 -1- 烯 -1-
基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)-1-甲基-N-(2,2,2-三氟乙基)
肼甲醯胺(F8)



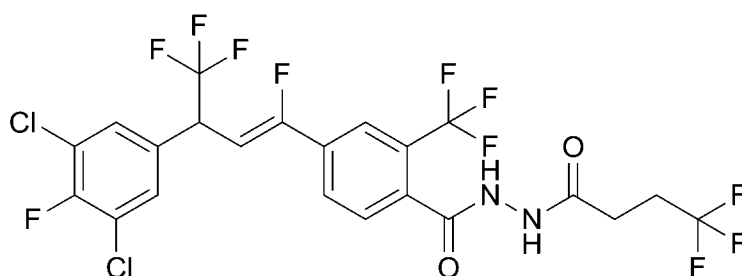
【0147】單離為黃色膠(0.110 g，38%)。

(Z)-4-(3-(3,5- 二 溴 苯 基)-1,4,4,4- 四 氟 丁 -1- 烯 -1-
基)-N'-(4,4,4-三氟丁基)-2-(三氟甲基)苯甲醯肼(F9)



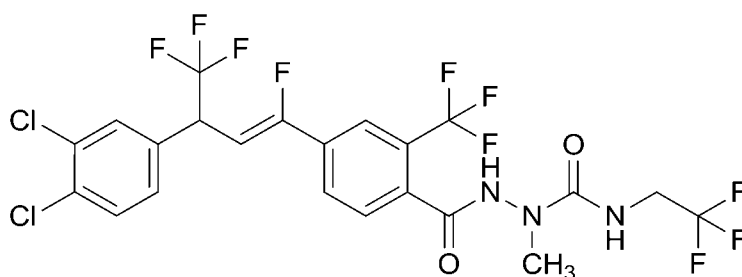
【0148】單離為黃色固體 (0.145 g，58%)。

(Z)-4-(3-(3,5-二氯-4-氟苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-N'-(4,4,4-三氟丁醯基)-2-(三氟甲基)苯甲醯肼(F10)



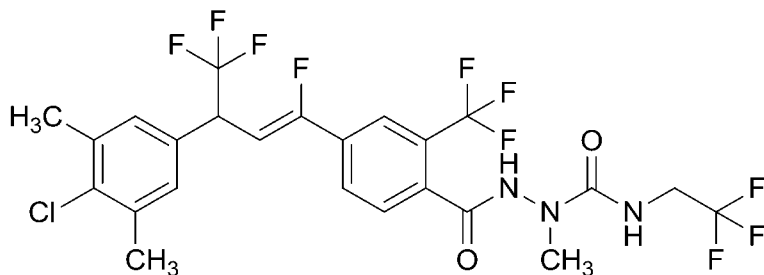
【0149】單離為黃色固體(0.120 g，47%)。

(Z)-2-(4-(3-(3,4-二氯苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)-1-甲基-N-(2,2,2-三氟乙基)肼甲醯胺(F15)



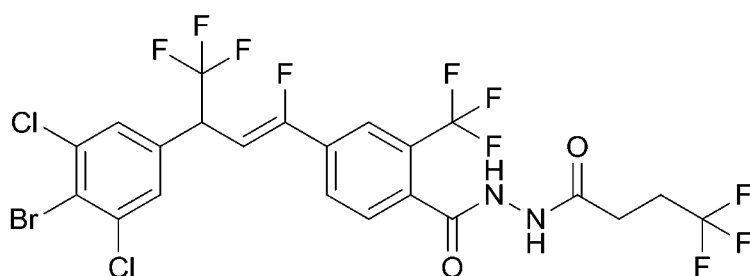
【0150】單離為黃色膠(0.110 g，37%)。

(Z)-2-(4-(3-(4-氯-3,5-二甲基苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)-1-甲基-N-(2,2,2-三氟乙基)肼甲醯胺(F16)



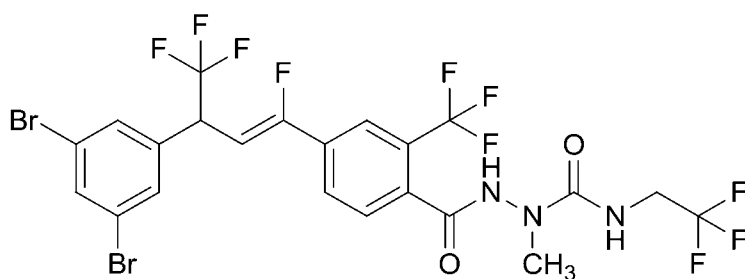
【0151】單離為黃色膠 (0.100 g , 33%)。

(Z)-4-(3-(4-溴-3,5-二氯苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-N'-(4,4,4-三氟丁基)-2-(三氟甲基)苯甲醯肼(F27)



【0152】單離為灰白色固體(0.110 g , 46%)。

實施例15：(Z)-2-(4-(3-(3,5-二溴苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)-1-甲基-N-(2,2,2-三氟乙基)肼甲醯胺(F14)之製備

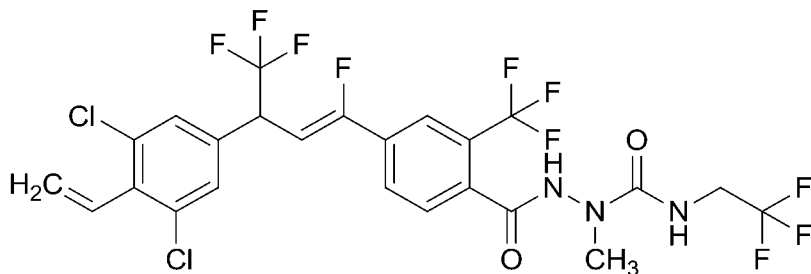


【0153】於室溫下將二異丙基乙胺(0.17 mL , 0.98 mmol)、2-(7-氧化苯并三氮唑)-N,N,N',N'-四甲基脲六氟磷酸酯(0.14 g , 0.36 mmol)及1-胺基-1-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基)脲鹽酸鹽(0.074 g , 0.36 mmol)添加至配於二氯甲烷之(Z)-4-(3-(3,5-二溴苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-

基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C8) (0.18 g, 0.33 mmol)溶液，以及攪拌6小時。反應混合物繼而用二氯甲烷予以稀釋且用水來清洗。分離的有機層係於硫酸鈉上乾燥、過濾以及濃縮。藉由使用25%乙酸乙酯/石油醚作為溶析液之急速管柱層析法予以純化，提供如淺黃色固體之標題化合物(0.14 g, 51%)。

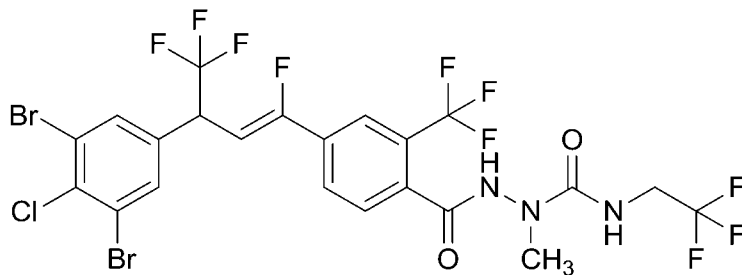
【0154】 下列化合物係以實施例15中概述之流程相似的方式予以製備：

(Z)-2-(4-(3-(3,5-二氯-4-乙烯基苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)-1-甲基-N-(2,2,2-三氟乙基)肼甲醯胺(F17)



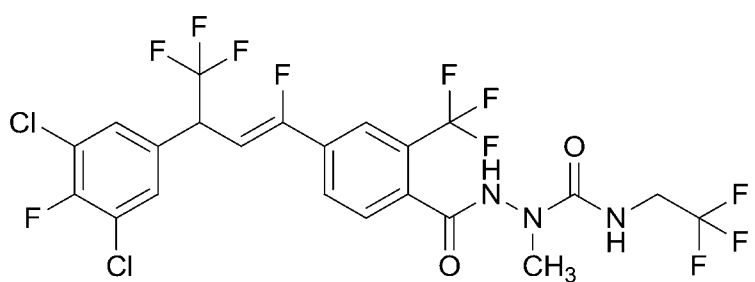
【0155】 單離為淺黃色膠(0.060 g, 25%)。

(Z)-2-(4-(3-(3,5-二溴-4-氯苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)-1-甲基-N-(2,2,2-三氟乙基)肼甲醯胺(F18)



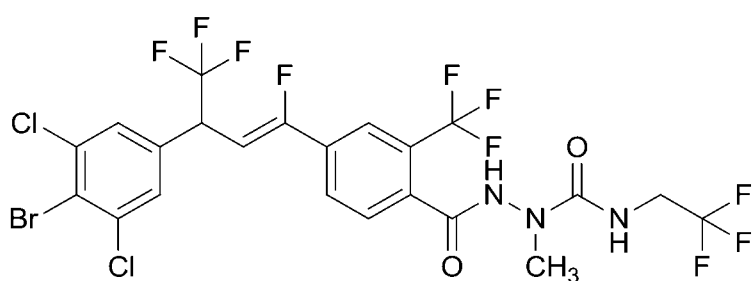
【0156】 單離為黃色黏性固體(0.105 g, 28%)。

(Z)-2-(4-(3-(3,5-二氯-4-氟苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)-1-甲基-N-(2,2,2-三氟乙基)肼甲醯胺(F22)



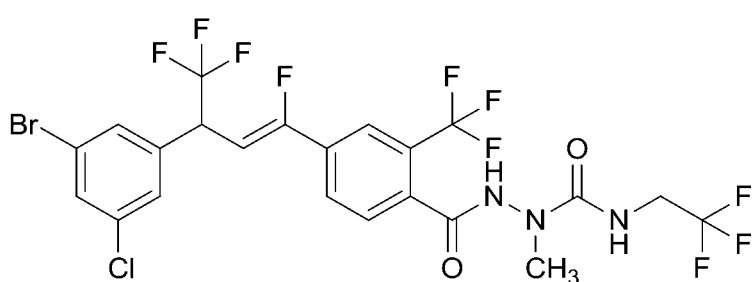
【0157】單離為黃色固體 (0.105 g，43%)。

(Z)-2-(4-(3-(4-溴-3,5-二氯苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)-1-甲基-N-(2,2,2-三氟乙基)肼甲醯胺(F23)



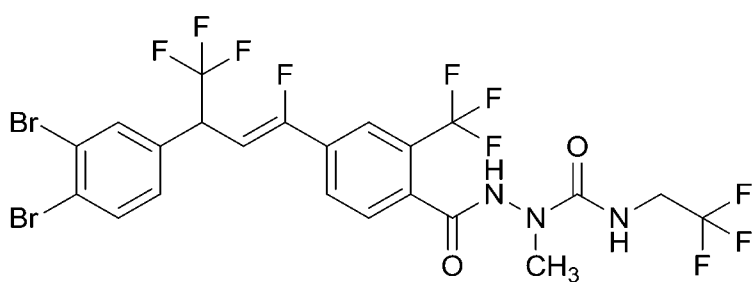
【0158】單離為淺黃色膠(0.078 g，20%)。

(Z)-2-(4-(3-(3-溴-5-氯苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)-1-甲基-N-(2,2,2-三氟乙基)肼甲醯胺(F25)



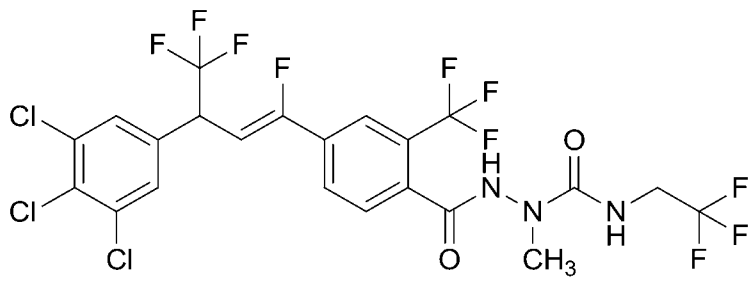
【0159】單離為灰白色固體(0.095 g，38%)。

(Z)-2-(4-(3-(3,4- 二 溴 苯 基)-1,4,4,4- 四 氟 丁 -1- 烯 -1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)-1-甲基-N-(2,2,2-三氟乙基)肼甲醯胺(F26)



【0160】單離為黃色膠(0.148 g，57%)。

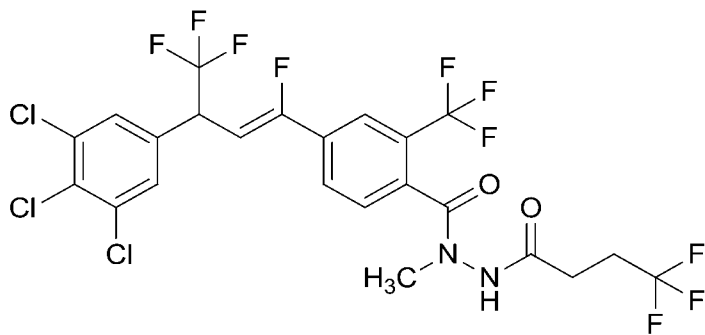
實施例16：(Z)-1-甲基-2-(4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)-N-(2,2,2-三氟乙基)肼甲醯胺(F1)之製備



【0161】步驟 1. (Z)-N'- 甲 基 -4-(1,4,4,4- 四 氟 -3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯肼鹽酸鹽：將(Z)-三級丁基 1-甲基-2-(4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)肼甲酸酯(C59) (1.00 g，1.60 mmol)、二氯甲烷(16 mL)及氯化氫(4 M配於二噁烷，0.400 mL，1.60 mmol)添加至100 mL圓底燒瓶，以提供黃色溶液。使反應於室溫下攪拌歷時6小時，繼而濃縮，以提供黃色泡沫，其能未經進一步純化或特徵化即使用。

【0162】步驟 2. (Z)-1- 甲基 -2-(4-(1,4,4,4- 四 氟 -3-(3,4,5-三 氯 苯 基) 丁 -1- 烯 -1- 基)-2-(三 氟 甲 基) 苯 甲 醯 基)-N-(2,2,2- 三 氟 乙 基) 肼 甲 醯 胺 : 將 (Z)-N'- 甲 基 -4-(1,4,4,4- 四 氟 -3-(3,4,5- 三 氯 苯 基) 丁 -1- 烯 -1- 基)-2-(三 氟 甲 基) 苯 甲 醯 肼 鹽 酸 鹽 (0.150 g , 0.268 mmol)、二 異 丙 基 乙 胺 (0.140 mL , 0.803 mmol) 及 乙 腈 (2.7 mL) 添 加 至 一 個 25 mL 小 瓶 , 以 提 供 黃 色 溶 液 。 添 加 4- 硝 基 苯 基 (2,2,2- 三 氟 乙 基) 胺 甲 酸 酯 (0.106 g , 0.402 mmol) , 以 及 使 反 應 於 室 溫 下 攪 拌 過 夜 。 反 應 混 合 物 係 用 含 水 碳 酸 氫 鈉 來 驟 冷 , 用 二 氯 甲 烷 萃 取 , 濃 縮 , 以 及 藉 由 逆 相 急 速 管 柱 層 析 法 直 接 純 化 , 以 提 供 如 黃 色 油 之 標 題 化 合 物 (0.0968 g , 52%) 。

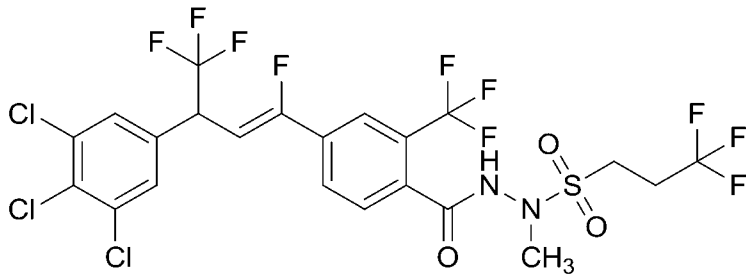
實施例 17 : (Z)-N- 甲 基 -4-(1,4,4,4- 四 氟 -3-(3,4,5- 三 氯 苯 基) 丁 -1- 烯 -1- 基)-N'-(4,4,4- 三 氟 丁 醯 基)-2-(三 氟 甲 基) 苯 甲 醯 肼 (F13) 之 製 備



【0163】將 (Z)-4-(1,4,4,4- 四 氟 -3-(3,4,5- 三 氯 苯 基) 丁 -1- 烯 -1- 基)-2-(三 氟 甲 基) 苯 甲 酸 (C2) (0.120 g , 0.242 mmol)、亞 硫 醯 氯 (0.0317 g , 0.266 mmol) 及 1,2- 二 氯 乙 烷 (5 mL) 裝 入 一 個 25 mL 圓 底 燒 瓶 。 生 成 的 混 合 物 加 熱 回

流2小時，冷卻至室溫，然後濃縮。使此殘餘物溶解於二氯甲烷內，以及於0℃下逐滴地添加至配於二氯甲烷(5 mL)之溶液，該溶液含有4,4,4-三氟-N'-甲基丁烷肼鹽酸鹽(0.0550 g，0.266 mmol)及三乙胺(0.0515 g，0.508 mmol)。使反應於室溫下攪拌過夜。反應混合物用二氯甲烷來稀釋，用稀釋鹽酸、含水碳酸氫鈉予以清洗，於硫酸鎂上乾燥，過濾以及濃縮。藉由使用2%丙酮/二氯甲烷作為溶析液之急速管柱層析法予以純化，提供如白色泡沫之標題化合物(0.0820 g，52%)。

實施例18：(Z)-3,3,3-三氟-N-甲基-N'-(4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)丙-1-磺醯肼(**F19**)之製備



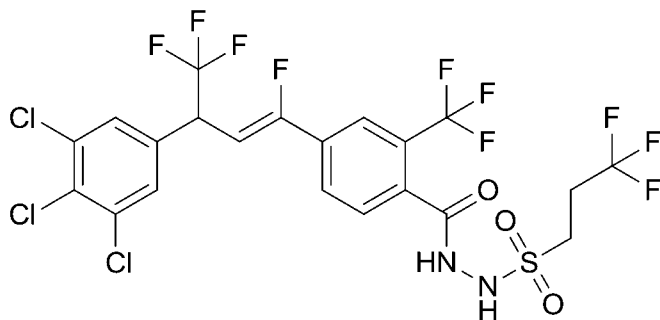
【0164】步驟1. (Z)-N'-甲基-(4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯肼鹽酸鹽：將(Z)-三級丁基 1-甲基-2-(4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)肼甲酸酯(**C60**) (1.00 g，1.60 mmol)、二氯甲烷(16 mL)及氯化氫(4 M配於二噁烷，0.400 mL，1.60 mmol)添加至100 mL圓底燒瓶，以提供黃色溶液。使反應於室溫下攪拌歷時6小時，繼而濃縮減少以提供黃色泡沫，其能

未經進一步純化或特徵化即使用。

【0165】步驟 2. (Z)-3,3,3- 三 氟 -N- 甲 基 -N'-(4-(1,4,4,4- 四 氟 -3-(3,4,5- 三 氯 苯 基) 丁 -1- 烯 -1- 基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)丙-1-磺醯肼(F19)：將(Z)-N'- 甲基 -4-(1,4,4,4- 四 氟 -3-(3,4,5- 三 氯 苯 基) 丁 -1- 烯 -1- 基)-2-(三氟甲基)苯甲醯肼鹽酸鹽(0.140 g , 0.250 mmol) 及1,2-二氯乙烷(3 mL)添加至一個25 mL小瓶。繼而添加 3,3,3-三氟丙-1-磺醯氯(0.0350 mL , 0.275 mmol)及4-甲 基嗎福林(0.0690 mL , 0.625 mmol)，以及旋渦振盪反應 混合物然後攪拌歷時48小時。混合物係經由一種聚四氟乙 烯注射器濾器來過濾以及於氮氣流下濃縮生成的液體。藉 由急速管柱層析法予以純化，提供如無色玻璃之標題化合 物(0.033 g , 17%)。

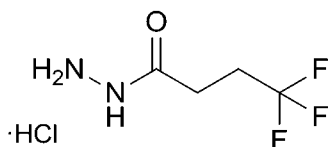
【0166】下列化合物係以實施例18中概述之流程相 似的方式予以製備：

(Z)-3,3,3-三氟-N'-(4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基) 丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)丙-1-磺醯肼(F24)



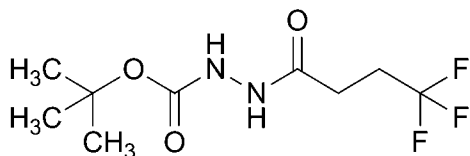
【0167】單離為無色玻璃(0.014 g , 12%)。

實施例19：4,4,4-三氟丁烷肼鹽酸鹽(C55)之製備



【0168】將氯化氫(4 N配於1,4-二噁烷，5.0 mL)添加至配於1,4-二噁烷(5 mL)之三級丁基 *N*-(4,4,4-三氟丁醯基)胺甲酸酯(**C64**) (1.5 g，5.9 mmol)溶液，以及於室溫下攪拌2小時。反應混合物係予以濃縮，且生成的殘餘物係用戊烷清洗、過濾以及真空下乾燥，以提供如灰白色固體之標題化合物(1.0 g，74%): mp 187-190 °C; ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 11.03 (br s, 1H), 10.60 - 10.41 (m, 3H), 2.56 - 2.45 (m, 4H); ESIMS m/z 156 ($[\text{M}-\text{HCl}]^+$)。

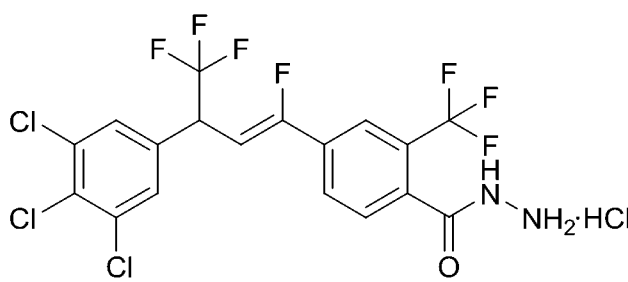
實施例20: 三級丁基 2-(4,4,4-三氟丁醯基)肼甲酸酯(**C56**)之製備



【0169】於-78 °C下添加及4-甲基嗎福林(1.6 g，16 mmol)至配於二氯甲烷(20 mL)之4,4,4-三氟丁酸(1.5 g，11 mmol)溶液以及攪拌5分鐘。添加異丁基碳酸氫酯(1.7 g，13 mmol)，以及使混合物攪拌另一個10分鐘。添加三級丁基 *N*-胺基胺甲酸酯(1.7 g，13 mmol)，以及反應係加溫至室溫歷時2小時。反應混合物係用二氯甲烷予以稀釋，用水清洗，於硫酸鈉上乾燥、過濾以及濃縮。藉由使用30%乙酸乙酯/石油醚作為溶析液之急速管柱層析法予

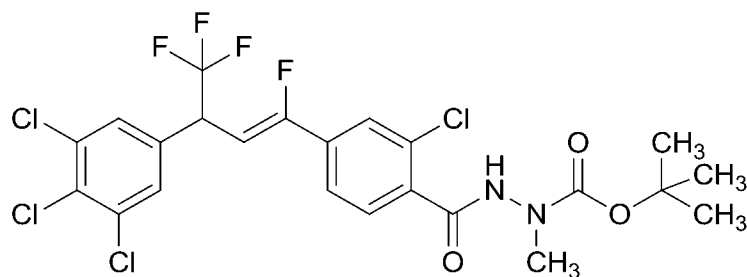
以純化，提供如灰白色固體之標題化合物(1.5 g, 52%): mp 95 - 98 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 7.19 (br s, 1H), 6.42 (s, 1H), 2.60 - 2.48 (m, 4H), 1.49 (s, 9H); ESIMS *m/z* 156 ([M-*tert* butyl CO]⁺)。

實施例21：三級丁基 2-(4,4,4-三氟丁醯基)肼甲酸酯(C57)之製備



【0170】將 (Z)- 三級丁基 2-(4-(1,4,4,4- 四 氟 -3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)肼甲酸酯(C61) (0.317 g, 0.520 mmol)及氯化氫(4 M 配於二噁烷, 5.00 mL, 20.0 mmol)添加至一個25 mL小瓶，以提供黃色溶液。攪拌溶液直到LCMS指示去保護完成為止。使反應濃縮，以提供如固體之標題化合物(0.280 g, 99%): ¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 11.69 (s, 1H), 8.22 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 8.12 (dd, *J* = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 8.06 (s, 2H), 7.74 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.87 (dd, *J* = 35.7, 10.1 Hz, 1H), 5.26 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H); ESIMS *m/z* 511 ([M+H]⁺)。

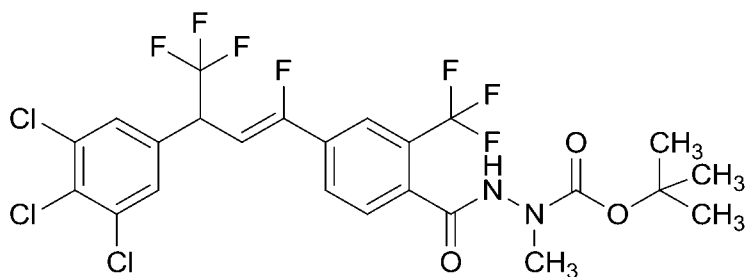
實施例22：(Z)-三級丁基 2-(2-氯-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)苯甲醯基)-1-甲基肼甲酸酯(C58)



【0171】將(*Z*)-2-氯-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)苯甲酸(**C4**) (0.290 g, 0.628 mmol)、三級丁基 1-甲基胍甲酸酯鹽酸鹽(0.172 g, 0.941 mmol)、((1*H*-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)氧)三(吡咯啉-1-基)磷六氟磷酸酯(V) (0.490 g, 0.941 mmol)及二氯甲烷(6.3 mL)添加至一個25 mL小瓶，以提供橘色懸浮液。添加三乙胺(0.350 mL, 2.51 mmol)且使反應混合物於室溫下攪拌過夜。使溶劑濃縮，以及殘餘物係藉由急速管柱層析法予以純化，以提供如無色油之標題化合物(0.361 g, 88%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.55 (s, 1H), 7.60 (d, $J = 1.6$ Hz, 1H), 7.56 - 7.46 (m, 1H), 7.44 (s, 2H), 5.81 (dd, $J = 32.6, 9.6$ Hz, 1H), 4.60 (p, $J = 8.9$ Hz, 1H), 3.23 (s, 3H), 1.48 (s, 9H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -69.39, -112.07; ESIMS m/z 589 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

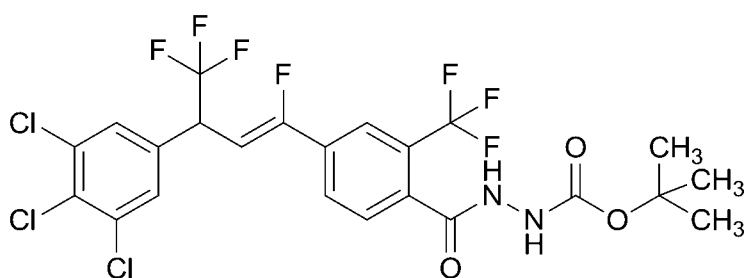
【0172】下列化合物係以實施例22中概述之流程相似的方式予以製備：

(*Z*)-三級丁基 1-甲基-2-(4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)胍甲酸酯(**C59**)



【0173】單離為黃色油(0.060 g, 55%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.88 (s, 1H), 7.79 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.44 (s, 2H), 5.85 (dd, $J = 32.5, 9.6$ Hz, 1H), 4.61 (p, $J = 8.9$ Hz, 1H), 3.23 (s, 3H), 1.50 (s, 9H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -59.13, -69.31 (d, $J = 2.3$ Hz), -111.99 (d, $J = 37.0$ Hz); ESIMS m/z 623 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

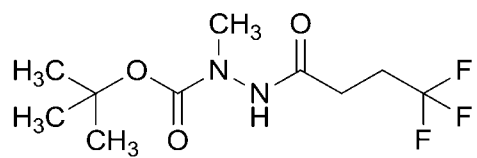
實施例23：(Z)-三級丁基 2-(4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)肼甲酸酯 (C60)之製備



【0174】將配於二噁烷(10 mL)之(Z)-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯氯(C22) (0.490 g, 0.953 mmol)添加至一個25 mL小瓶，以提供橘色溶液。添加三級丁基 肼甲酸酯(0.504 g, 3.81 mmol)且反應混合物係藉由震盪予以攪拌。當LCMS分析判斷反應完成時，使溶劑濃縮。生成的橘色油係溶解

於乙酸乙酯內，用含水檸檬酸(5%)、水、鹽水清洗，於硫酸鎂上乾燥、過濾以及濃縮。藉由使用0-100%乙酸乙酯/己烷作為溶析液之急速管柱層析法予以純化，接著得到的固體係於40℃真空烘箱內乾燥3小時，提供如黃色固體之標題化合物(0.571 g，88%): ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3) δ 7.90 - 7.87 (m, 1H), 7.79 (dd, J = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.76 - 7.71 (m, 1H), 7.56 (s, 1H), 7.44 (s, 2H), 6.70 (s, 1H), 5.85 (dd, J = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 4.61 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 1.50 (s, 9H); ^{19}F NMR (471 MHz, CDCl_3) δ -59.26, -69.29 (d, J = 8.8 Hz), -112.01 (d, J = 32.4 Hz); IR(薄膜) 3283, 2983, 1737, 1681 cm^{-1} 。

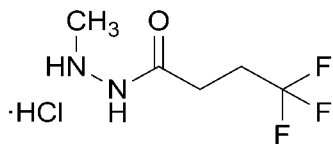
實施例24：三級丁基 1-甲基-2-(4,4,4-三氟丁醯基)肼甲酸酯(C62)之製備



【0175】將三級丁基 1-甲基肼甲酸酯(0.301 g，2.06 mmol)、三乙胺(0.217 g，2.15 mmol)及二氯甲烷(15 mL)添加至100 mL圓底燒瓶，以提供無色溶液。使反應冷卻至0℃，以及過1小時後添加配於二氯甲烷(5 mL)之4,4,4-三氟丁醯氯(0.300 g，1.87 mmol)溶液。允許反應於0℃下攪拌另外1小時，接著於室溫下攪拌15小時。將反應混合物轉移至一分液漏斗；用含水碳酸鈉、水及鹽水清洗；以及於硫酸鎂上乾燥、過濾及濃縮，提供如黃色液體之標題化合物(0.490 g，97%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ

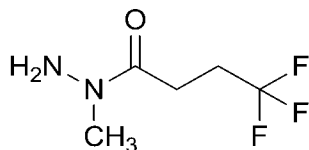
7.27 (s, 1H), 3.14 (d, $J = 10.6$ Hz, 3H), 2.50 (dddd, $J = 23.7, 17.4, 9.2, 5.4$ Hz, 4H), 1.47 (m, 9H)。

實施例25：4,4,4-三氟-*N'*-甲基丁烷肼鹽酸鹽(C63)之製備



【0176】將氯化氫(4 N配於1,4-二噁烷，5.0 mL)添加至配於1,4-二噁烷(5 mL)之三級丁基 *N*-(4,4,4-三氟丁醯基胺基)胺甲酸酯(C62) (0.490 g，1.813 mmol)溶液，以及於室溫下攪拌2小時。反應係予以濃縮，且殘餘物係用戊烷清洗、過濾以及真空下乾燥，以提供如灰白色固體之標題化合物(0.350 g，93%): mp 167-170 °C; ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 11.20 (s, 1H), 10.80 - 10.30 (br s, 3H), 2.70 - 2.53 (m, 4H); ^{19}F NMR (376 MHz, DMSO- d_6) δ -65.19; ESIMS m/z 170 ($[\text{M}-\text{HCl}]^+$)。

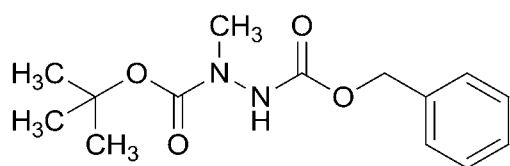
實施例26：4,4,4-三氟-*N*-甲基丁烷肼鹽酸鹽(C64)之製備



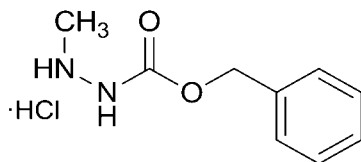
【0177】將甲基肼(7.81 g，169 mmol)及二氯甲烷(150 mL)添加至500 mL圓底燒瓶，以提供無色溶液。使反應容器冷卻至0 °C，以及於2小時內添加配於二氯甲烷(50 mL)之4,4,4-三氟丁醯氯(2.72 g，16.9 mmol)溶液。反應混合物於0°C下攪拌另外1小時，然後於室溫下歷時15小時。將反應混合物轉移至一分液漏斗；用含水碳酸鈉、水及鹽水清洗；以及於硫酸鎂上乾燥、過濾以及濃縮，提

供如黃色液體之標題化合物(2.91 g, 91%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 3.77 (s, 2H), 3.20 (s, 3H), 2.95 - 2.84 (m, 2H), 2.51 - 2.34 (m, 2H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl_3) δ 172.82, 127.22 (q, $J_{\text{CF}} = 276.0$ Hz), 38.72, 29.54 (q, $J_{\text{CF}} = 29.3$ Hz), 25.69 (q, $J_{\text{CF}} = 3.1$ Hz); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -66.70。

實施例27：2-苯甲基 1-三級丁基 1-甲基肼-1,2-二甲酸酯 (C65)之製備

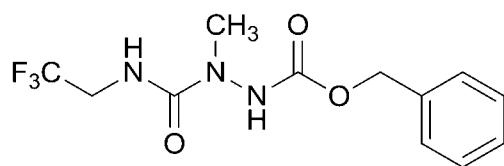


【0178】將三級丁基 1-甲基肼甲酸酯(5.00 g, 34.2 mmol)及二氯甲烷(100 mL)添加至一250 mL圓底燒瓶，以提供無色溶液。將氫氧化鈉(1.0 M, 33.0 mL)然後苯甲基碳醯氯酯(5.84 g, 34.2 mmol)添加至反應混合物，以及於室溫下攪拌2小時。將反應混合物轉移至一分液漏斗；用含水碳酸鈉、水及鹽水清洗；於硫酸鎂上乾燥、過濾以及濃縮。藉由急速管柱層析法予以純化，提供如白色固體之標題化合物(8.50 g, 81%): mp 71-73 °C; ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.47 – 7.32 (m, 5H), 6.54 (br s, 1H), 5.17 (s, 2H), 3.14 (s, 3H), 1.42 (s, 9H); IR(薄膜) 3294, 2977, 1704, 1366, 1152 cm^{-1} ; ESIMS m/z 279 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。實施例28：苯甲基 2-甲基肼甲酸酯鹽酸鹽(C66)之製備



【0179】將氯化氫(4 N配於二噁烷，5.0 mL)添加至配於二噁烷(100 mL)之2-苯甲基 1-三級丁基 1-甲基肼-1,2-二甲酸酯(**C65**) (8.5 g，30 mmol)溶液，以及於室溫下攪拌2小時。反應係予以濃縮，且生成的殘餘物係用戊烷清洗、過濾以及真空下乾燥，以提供如灰白色固體之標題化合物(6.0 g，87%): mp 164-166 °C; ^1H NMR (400 MHz, 甲醇- d_4) δ 7.53 - 7.18 (m, 5H), 5.25 (s, 2H), 2.93 (s, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, DMSO- d_6) δ 153.79, 134.03, 126.98, 126.96, 126.73, 66.83, 34.14。

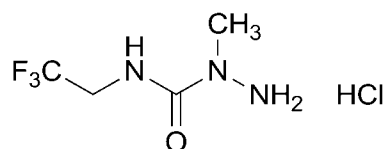
實施例29：2-苯甲基 2-甲基-2-((2,2,2-三氟乙基)胺甲鹽基)肼甲酸酯(**C67**)之製備



【0180】將配於二氯甲烷(20 mL)之三光氣(1.98 g，6.66 mmol)添加至250 mL圓底燒瓶，以提供無色溶液。使反應冷卻至-40 °C，以及於1小時內添加配於二氯甲烷(10 mL)之2,2,2-三氟乙胺(2.00 g，20.2 mmol)及三乙胺(4.09 g，40.4 mmol)溶液。允許反應於-40 °C下攪拌另外的半小時。於半小時內將配於二氯甲烷(30 mL)之苯甲基 2-甲基肼甲酸酯鹽酸鹽(**C67**)溶液添加至反應混合物，以

及允許反應混合物加溫至室溫且攪拌另外2小時。將反應混合物轉移至一分液漏斗；用含水碳酸鈉、水及鹽水清洗；於硫酸鎂上乾燥、過濾以及濃縮，提供如黃色液體之標題化合物(3.8 g, 40%)。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 9.50 (br s, 1H), 7.37 - 7.33 (m, 6H), 5.11 (s, 2H), 3.82 - 3.73 (m, 2H), 2.95 (s, 3H); IR(薄膜) 3332, 1735, 1161, 742 cm⁻¹; ESIMS *m/z* 306.09 ([M+H]⁺)。

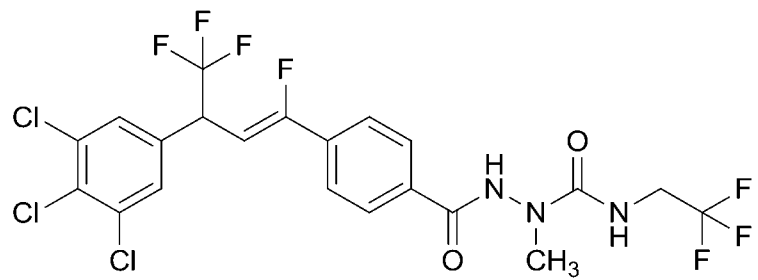
實施例30：1-甲基-*N*-(2,2,2-三氟乙基)肼甲醯胺(C68)之製備



【0181】將附於碳上之鈀(10%，0.30 g)添加至配於甲醇(30 mL)之苯甲基 *N*-(2,2,2-三氟乙基胺甲醯基胺基)胺甲酸酯(C67)攪拌溶液(2.5 g, 8.19 mmol)。反應混合物係於氮氣氛圍(30 psi)下、於室溫攪拌12小時。反應混合物係予以過濾及濃縮。使得到的固體溶解於1,4-二噁烷(20 mL)以及添加氯化氫(1 N配於1,4-二噁烷，2.5 mL)。使混合物於室溫下攪拌1小時然後濃縮。生成的固體係用乙酸乙酯清洗，且於減壓下乾燥，以提供如白色固體之標題化合物(1.2 g, 44%)：¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 9.40 (br s, 3H), 7.97 (br s, 1H), 3.94 - 3.78 (m, 2H), 3.13 (s, 3H); IR(薄膜) 3243, 1679, 1565, 1157, 648 cm⁻¹; ESIMS *m/z* 171.2 ([M]⁺)。

實施例31：(*Z*)-1-甲基-2-(4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯

苯基)丁-1-烯-1-基)苯甲醯基)-*N*-(2,2,2-三氟乙基)肼甲醯胺(FC1)之製備



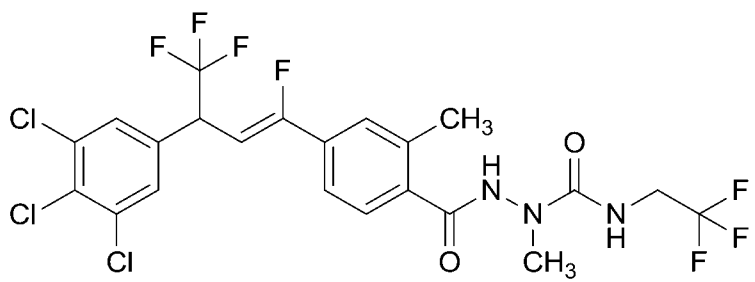
【0182】步驟 1. (*Z*)-*N'*- 甲基 -4-(1,4,4,4- 四 氟 -3-(3,4,5- 三 氯 苯 基) 丁 -1- 烯 -1- 基) 苯 甲 醯 肼 鹽 酸 鹽 (CC3)：將配於二氯甲烷(0.9 mL)之(*Z*)-三級丁基 1-甲基 -2-(4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)苯甲醯基)肼甲酸酯(CC2) (0.100 g, 0.180 mmol)、氯化氫 (4 M配於二噁烷, 4 mL)添加至一個25 mL小瓶, 以提供黃色溶液。溶液攪拌過夜。使反應濃縮, 以及殘餘物能立即使用於下一個步驟。

【0183】步驟 2. (*Z*)-1- 甲 基 -2-(4-(1,4,4,4- 四 氟 -3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)苯甲醯基)-*N*-(2,2,2-三氟乙基)肼甲醯胺：將(*Z*)-*N'*- 甲基 -4-(1,4,4,4- 四 氟 -3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)苯甲醯肼鹽酸鹽(CC3) (0.100 g, 0.203 mmol)、二異丙基乙胺(0.142 mL, 0.813 mmol)及乙腈(2.0 mL)添加至一個25 mL小瓶, 以提供黃色溶液。添加4-硝基苯基 (2,2,2-三氟乙基)胺甲酸酯 (0.107 g, 0.406 mmol), 以及使反應於室溫下攪拌過夜。反應係用含水碳酸氫鈉來驟冷, 用二氯甲烷萃取, 以及藉由逆相急速管柱層析法純化, 以提供如黃色油之標題化合

物(0.0321 g，25%)。

【0184】 下列化合物係以實施例31 中概述之流程相似的方式予以製備：

(Z)-1-甲基-2-(2-甲基-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)苯甲醯基)-N-(2,2,2-三氟乙基)肼甲醯胺(F28)

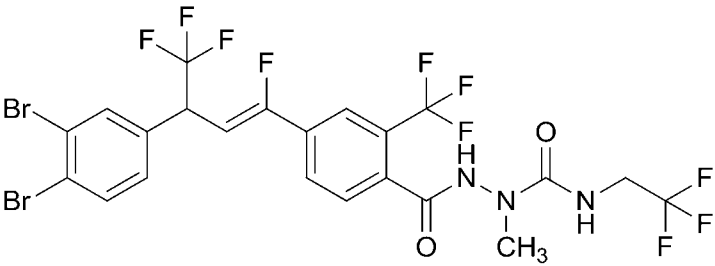
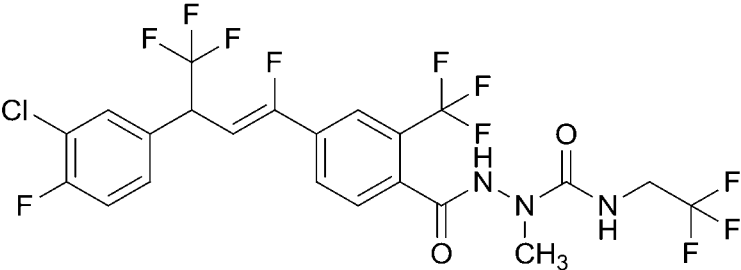
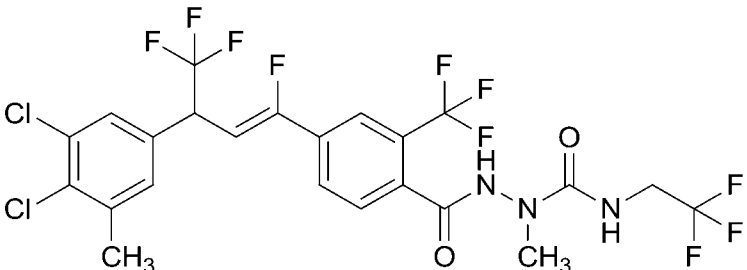
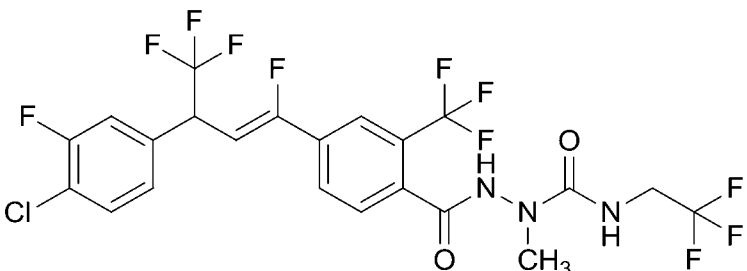
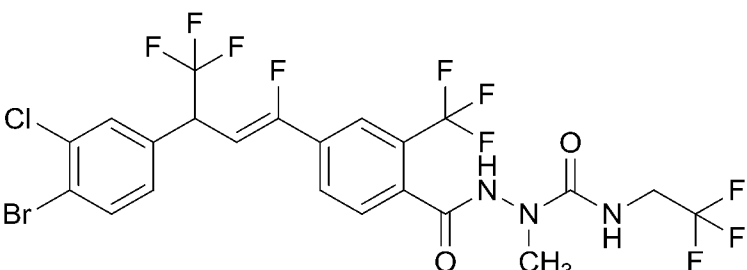
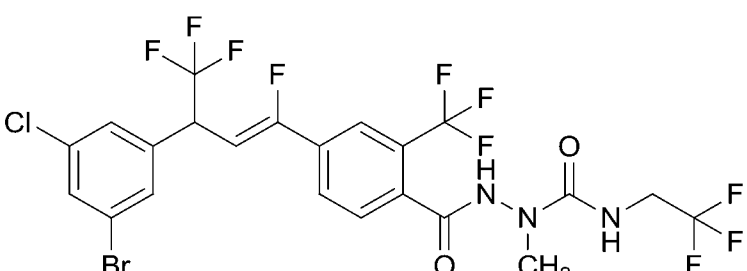


【0185】 單離為黃色油(0.062 g，34%)。

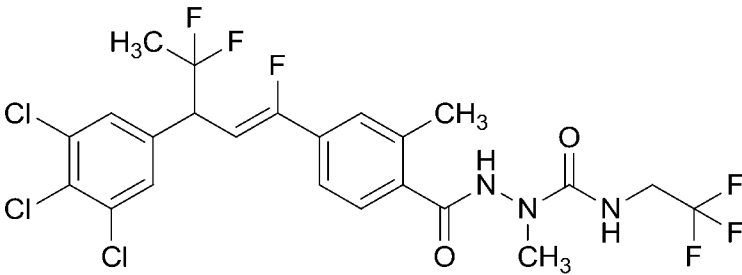
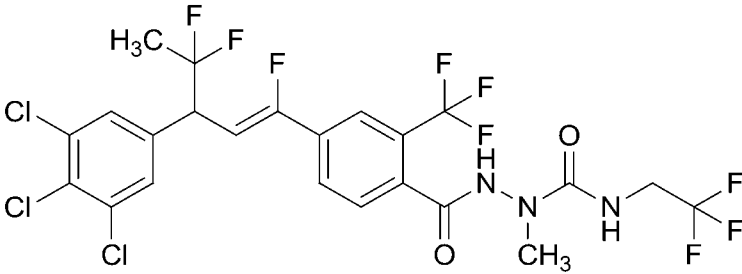
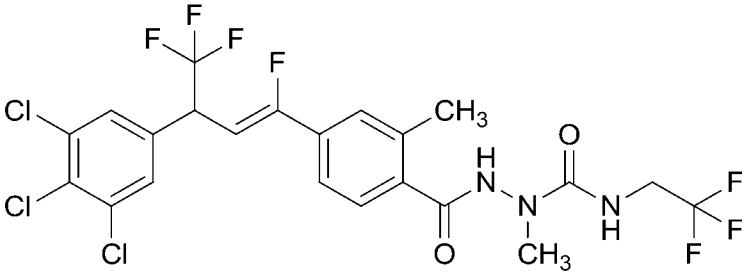
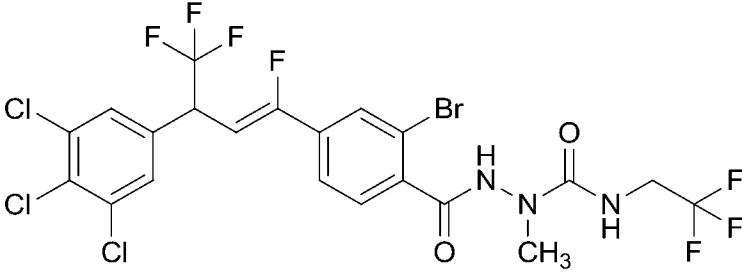
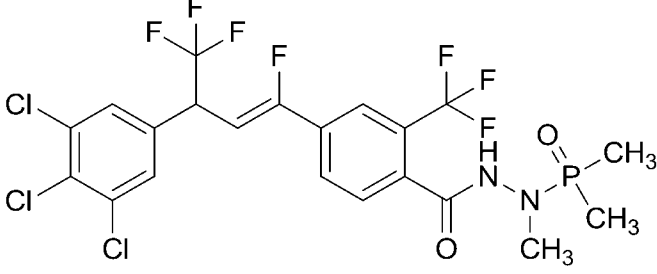
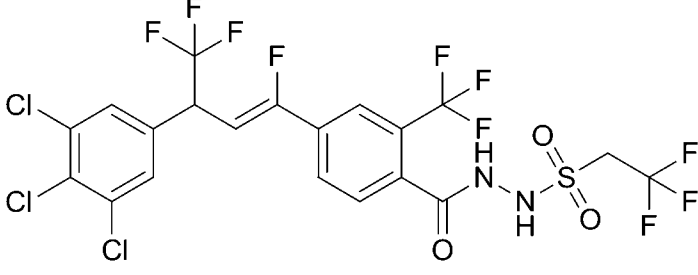
【0186】 下列表1內的化合物可以依據揭示的流程予以製備：P1、P2、P3、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P18、P19及P20。

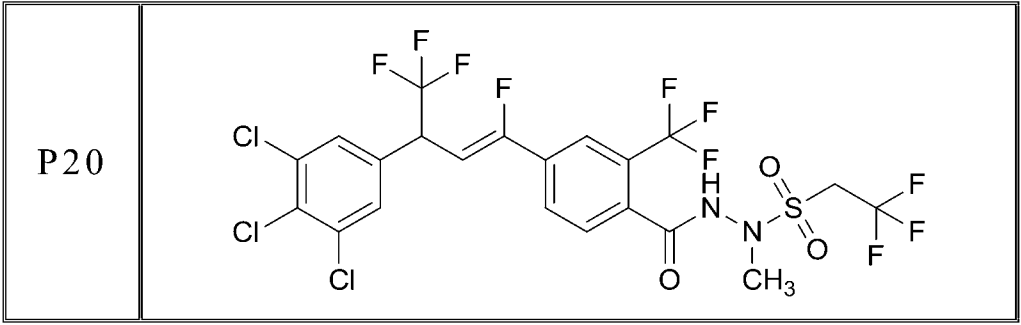
表1. 預言性的分子之結構和製備方法

編號	結構
P1	

P2	
P3	
P4	
P5	
P6	
P7	

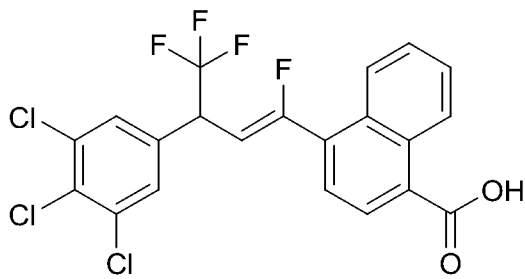
P8	
P9	
P10	
P11	
P12	
P13	

P14	
P15	
P16	
P17	
P18	
P19	



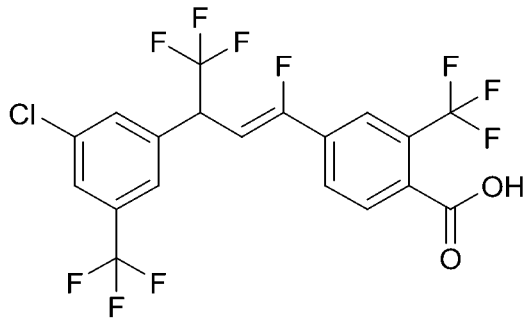
【0187】 下列化合物係以實施例1 中概述之流程相似的方式予以製備：

(Z)-4-(1,4,4,4- 四 氟 -3-(3,4,5- 三 氯 苯 基) 丁 -1- 烯 -1-基)-1-萘甲酸(C69)

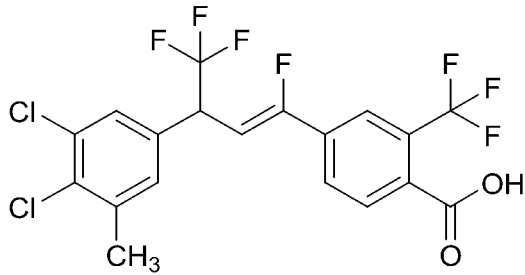


【0188】 單離為黃色固體(0.85 g，53%): ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 8.30 (d, *J* = 7.5 Hz, 1H), 8.07 - 8.05 (m, 1H), 7.70 - 7.61 (m, 4H), 7.49 (s, 2H), 5.69 (dd, *J* = 9.9, 31.2 Hz, 1H), 4.75 - 4.69 (m, 1H); IR(薄膜) 3445, 1684, 1260, 750 cm⁻¹; ESIMS *m/z* 475.23 ([M]⁻)。

(Z)-4-(3-(3-氯-5-(三氟甲基)苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C70)



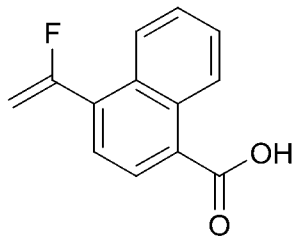
【0189】單離為棕色固體(1.0 g , 47%): ^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 13.80 (s, 1H), 8.17 - 8.12 (m, 3H), 7.91 - 7.86 (m, 3H), 6.87 (dd, $J = 9.9, 36.0$ Hz, 1H), 5.39 - 5.32 (m, 1H); ESIMS m/z 493.14 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。
(*Z*)-4-(3-(3,4-二氯-5-甲基苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲酸(C71)



【0190】單離為棕色膠(1.7 g , 42%): ^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 13.80 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.09 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.91 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 6.87 (dd, $J = 9.9, 36.0$ Hz, 1H), 5.13 - 5.07 (m, 1H), 2.42 (s, 3H); IR(薄膜) 3446, 2928, 1716 cm^{-1} ; ESIMS m/z 473.10 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

【0191】下列化合物係以實施例7中概述之流程相似的方式予以製備：

(4-(1-氟乙基)-1-萘甲酸(C72))

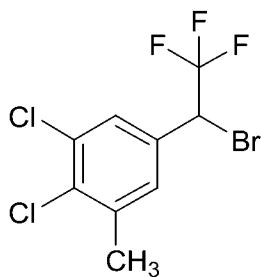


【0192】單離為灰白色固體(0.70 g , 52%): mp 154 –

156 °C: ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 13.40 (br s, 1H), 8.88 - 8.84 (m, 1H), 8.17 - 8.10 (m, 2H), 7.75 - 7.66 (m, 3H), 5.39 (dd, $J = 3.6, 17.2$ Hz, 1H), 5.23 (dd, $J = 36.0, 50.4$ Hz, 1H); ESIMS m/z 215.20 ($[\text{M}-\text{H}]^-$)。

【0193】 下列化合物係以實施例8中概述之流程相似的方式予以製備：

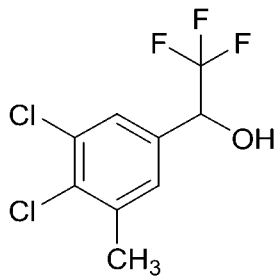
5-(1-溴-2,2,2-三氟乙基)-1,2-二氯-3-甲苯(C76)



【0194】 單離為澄清油(6.7 g, 67%): ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 7.46 (s, 1H), 7.28 (s, 1H), 5.02 (q, $J = 7.2$ Hz, 1H), 2.45 (s, 3H); IR(薄膜) 1260, 1113, 750 cm^{-1} ; EIMS m/z 322 ($[\text{M}]^+$)。

【0195】 下列化合物係以實施例10中概述之流程相似的方式予以製備：

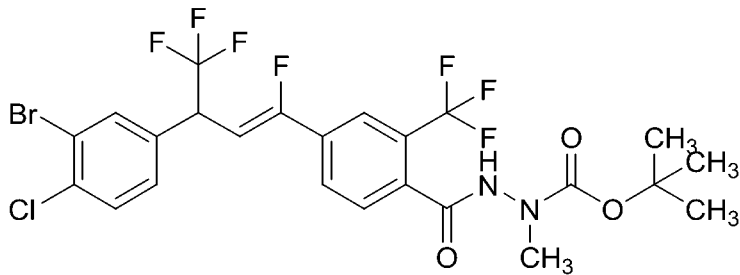
1-(3,4-二氯-5-甲基苯基)-2,2,2-三氟乙-1-醇(C77)



【0196】 單離為淺黃色油(4.6 g, 79%): ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 7.44 (s, 1H), 7.26 (s, 1H), 4.97 (q,

$J = 6.6 \text{ Hz}$, 1H), 2.44 (s, 3H); IR(薄膜) 3428, 1275, 1262, 750 cm^{-1} ; EIMS m/z 258 ($[\text{M}]^+$)。下列化合物係以實施例13中概述之流程相似的方式予以製備：

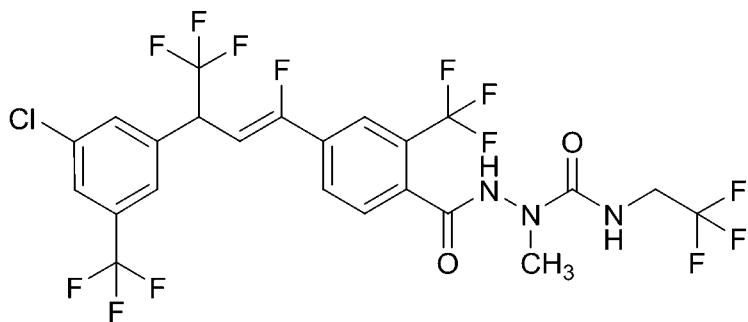
三級丁基 (Z)-2-(4-(3-(3-溴-4-氯苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)-1-甲基肼-1-甲酸酯 (C73)



【0197】單離為無色膠(0.400 g, 55%): ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 7.88 (s, 1H), 7.79 (d, $J = 7.5 \text{ Hz}$, 1H), 7.68 (d, $J = 1.9 \text{ Hz}$, 1H), 7.50 – 7.47 (m, 2H), 7.30 (dd, $J = 1.9, 8.4 \text{ Hz}$, 1H), 6.62 (dd, $J = 9.9, 32.7 \text{ Hz}$, 1H), 4.69 – 4.57 (m, 1H), 3.44 (s, 3H) 1.47 (s, 9H); ESIMS m/z 534.09 ($[\text{M}-\text{CO}_2\text{C}_4\text{H}_9]^+$)。

【0198】下列化合物係以實施例14中概述之流程相似的方式予以製備：

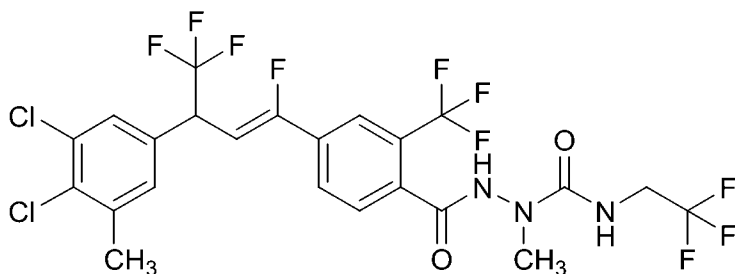
(Z)-2-(4-(3-(3-氯-5-(三氟甲基)苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)-1-甲基-N-(2,2,2-三氟乙基)肼-1-甲醯胺(PF9)



【0199】單離為棕色固體(0.040 g，22%)。

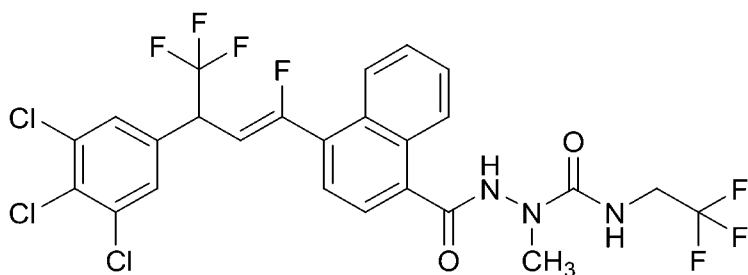
【0200】下列化合物係以實施例15中概述之流程相似的方式予以製備：

(Z)-2-(4-(3-(3,4-二氯-5-甲基苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)-1-甲基-N-(2,2,2-三氟乙基)肼-1-甲醯胺(F30)



【0201】單離為黃色固體(0.12 g，42%)。

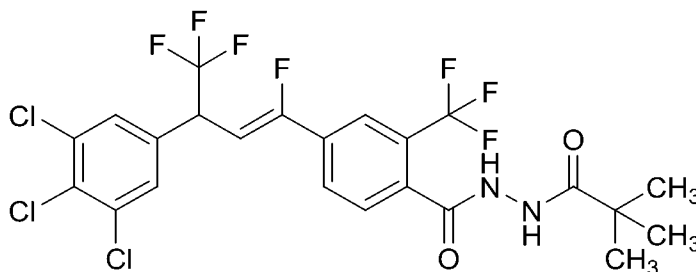
(Z)-1-甲基-2-(4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-1-萘甲醯基)-N-(2,2,2-三氟乙基)肼-1-甲醯胺(PF1)



【0202】單離為黃色膠(0.070 g，34%)。

【0203】 下列化合物係以實施例16中概述之流程相似的方式予以製備：

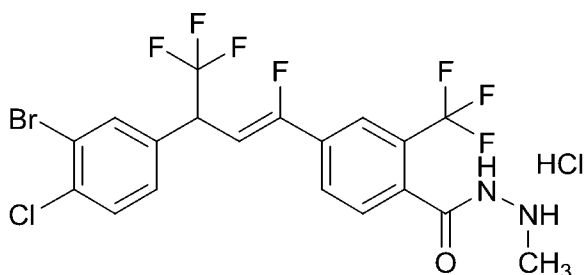
(Z)-N'-三甲基乙醯基-4-(1,4,4,4-四氟-3-(3,4,5-三氯苯基)丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯肼(F29)



【0204】 單離為黃色玻璃(0.058 g，60%)。

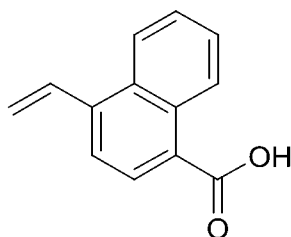
【0205】 下列化合物係以實施例21中概述之流程相似的方式予以製備：

(Z)-(4-(3-(3-溴-4-氯苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-N'-甲基-2-(三氟甲基)苯甲醯肼鹽酸鹽(C74)



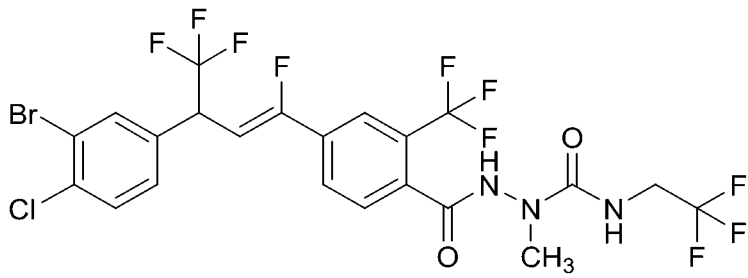
【0206】 單離為無色膠(0.250 g，74%): ESIMS m/z 535.13 ($[M+H]^+$)。

實施例32：4-乙烯基-1-萘甲酸(C75)之製備



【0207】將乙烯基三氟硼酸鉀(1.33 g, 9.96 mmol)、碳酸鉀(3.85 g, 27.9 mmol)及[1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵]二氧化鈮(II)(0.364 g, 0.498 mmol)添加至配於二甲基亞砜(32.3 mL)之4-溴-1-萘甲酸(2.50 g, 9.98 mmol)之攪拌溶液內。反應混合物係以80℃浴加熱歷時18小時。使反應混合物冷卻至周圍溫度，且用1 N含水鹽酸溶液(150 mL)及水(150 mL)予以稀釋。混合物係用乙酸乙酯來萃取。有機層係用鹽水清洗，於硫酸鈉上乾燥以及於減壓下濃縮，以提供粗製化合物。粗製化合物係藉由管柱層析法(SiO₂，以配於己烷之0-100%乙酸乙酯予以溶析)來純化，以提供如亮黃色固體之標題化合物(1.36 g, 62%): mp 147 – 155 °C; ¹H NMR (300 MHz, 丙酮-*d*₆) δ 11.42 (s, 1H), 9.16 – 9.03 (m, 1H), 8.31 – 8.25 (m, 2H), 7.77 (dd, *J* = 7.7, 0.7 Hz, 1H), 7.70 – 7.57 (m, 3H), 5.95 (dd, *J* = 17.2, 1.5 Hz, 1H), 5.62 (dd, *J* = 11.1, 1.5 Hz, 1H); ESIMS *m/z* 197.1 ([M-H]⁻)。

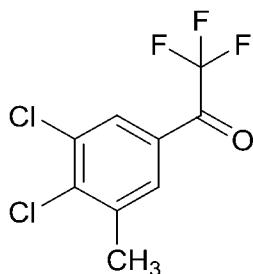
實施例33：(Z)-2-(4-(3-(3-溴-4-氯苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-2-(三氟甲基)苯甲醯基)-1-甲基-N-(2,2,2-三氟乙基)肼-1-甲醯胺(PF8)之製備



【0208】將4-硝基苯基 (2,2,2-三氟乙基)胺甲酸酯

(0.175 g, 0.70 mmol)及二異丙基乙胺(0.181 g, 1.4 mmol)添加至配於乙腈(10 mL)之(*Z*)-(4-(3-(3-溴-4-氯苯基)-1,4,4,4-四氟丁-1-烯-1-基)-*N'*-甲基-2-(三氟甲基)苯甲醯肼鹽酸鹽(**C74**)(0.200 g, 0.35 mmol)之攪拌溶液。使反應混合物於室溫下攪拌6小時，繼而於水及二氯甲烷之間進行分配。有機層係用鹽水清洗，於硫酸鈉上乾燥、以及於減壓下濃縮，以提供粗製化合物。藉由管柱層析法予以純化(SiO_2 ，以配於石油醚之30%乙酸乙酯予以溶析)，提供如淺黃色膠之標題化合物(0.105 g, 40%)。

實施例34：1-(3,4-二氯-5-甲基苯基)-2,2,2-三氟乙基-1-酮(C78**)之製備**



【0209】於氮氣下、將配於四氫呋喃之異丙基氯化鎂氯化鋰錯合物(26.8 mL, 34.8 mmol)添加至冰浴冷卻、配於四氫呋喃(65 mL)之5-溴-1,2-二氯-3-甲苯(6.9 g, 29 mmol)。1小時之後，添加2,2,2-三氟乙酸甲酯(3.79 mL, 37.7 mmol)。30分鐘之後，移除冰浴，以及溶液攪拌歷時1小時。反應混合物係用含水鹽酸(2 N)來驟冷。使混合物濃縮，以及用二氯甲烷來萃取。有機層係用鹽水清洗，於硫酸鈉上乾燥、過濾以及濃縮。藉由管柱層析法(SiO_2 ，石油醚)予以純化，以提供如白色固體之標題化合物(5.9

g, 80%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.00 (s, 1H), δ 7.83(s, 1H), 2.51 (s, 3H); EIMS m/z 256 ($[\text{M}]^+$)。

生物分析法

【0210】因為甜菜夜蛾(Beet Armyworm) (甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua*)、甘藍銀紋夜蛾(Cabbage Looper) (粉紋夜蛾(*Trichoplusia ni*)、玉米穗蟲(Corn Earworm) (棉鈴實夜蛾(*Helicoverpa zea*)、碧桃蚜蟲(Green Peach Aphid)(桃蚜(*Myzus persicae*), 以及黃熱病蚊(埃及斑蚊 (*Aedes aegypti*)會造成損失, 所以本文內含括下列對於其等的生物分析。再者, 甜菜夜蛾、玉米穗蟲及甘藍銀紋夜蛾為範大廣泛的嚼食性害蟲之三種良好的指標性物種。此外, 碧桃蚜蟲為範大廣泛的取食汁液害蟲之良好的指標性物種。此等四種指標性物種和黃熱病蚊一起的結果顯示出, 式1的分子於控制節肢動物門、軟體動物門, 及圓形動物門的害蟲方面之廣泛用途(關於進一步資訊, 參見 **Methods for the Design and Optimization of New Active Ingredients, Modern Methods in Crop Protection Research**, 由 Jeschke, P., Kramer, W., Schirmer, U., and Matthias W.編輯, p. 1-20, 2012)。

實施例A: 對甜菜夜蛾(**BEET ARMYWORM**) (甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua*), **LAPHEG**) (“**BAW**”)、玉米穗蟲 (**CORN EARWORM**) (棉鈴實夜蛾(*Helicoverpa zea*, **HELIZE**)(“**CEW**”) 與 甘 藍 銀 紋 夜 蛾 (**CABBAGE LOOPER**) (粉紋夜蛾 (*Trichoplusia ni*), **TRIPNI**)

(“CL”)之生物分析

【0211】甜菜夜蛾對於紫花苜蓿、蘆筍、甜菜(beets)、柑橘、玉米、棉花、洋蔥、豌豆、胡椒、馬鈴薯、大豆、甜菜(sugar beets)、向日葵、菸草、番茄以及其他作物而言，為經濟上嚴重關切的害蟲。其原產於東南亞但是現在於非洲、澳洲、日本、北美及南歐可找到。幼蟲可大規模取食，造成破壞性極大的作物損失。已知其對數種某些殺蟲劑有抗藥性。

【0212】甘藍銀紋夜蛾為全世界都可發現的嚴重害蟲。它會攻擊紫花苜蓿、豆類、甜菜(beets)、青花菜、甘藍、高麗菜、哈密瓜、花椰菜、芹菜、羽衣甘藍(collards)、棉花、黃瓜、茄子、甘藍(kale)、萵苣、甜瓜、芥菜、洋芹、豌豆、胡椒、馬鈴薯、大豆、菠菜、南瓜、番茄、蕪菁(turnip)及西瓜，以及其他作物。此物種貪婪的胃口，所以對於植物非常具破壞性。幼蟲每日會吃掉它們體重三倍的食物。取食處會明顯出現大量黏稠、濕潤之糞便。已知其對數種某些殺蟲劑有抗藥性。

【0213】玉米穗蟲被一些人認為是北美最昂貴的農作物害蟲。其常常攻擊有價值的作物，及作物收穫的部分。此害蟲會損害紫花苜蓿、洋薊、蘆筍、高麗菜、哈密瓜、羽衣甘藍(collards)、玉米、棉花、豇豆、黃瓜、茄子、萵苣、利馬豆(lima bean)、甜瓜、秋葵、豌豆、胡椒、馬鈴薯、南瓜(pumpkin)、四季豆、大豆、菠菜、南瓜(squash)、甘蔗、甘薯、番茄及西瓜，以及其他作物。再者，亦知道

此害蟲對某些殺蟲劑有抗藥性。

【0214】因此，基於上述因素，此等害蟲之控制係重要的。而且，控制此等已知為嚼食性害蟲之害蟲(BAW、CEW及CL)之分子，可用於控制其他嚼食植物之害蟲。

【0215】本文件中揭示之某些分子係使用下列實施例中所述之程序，來測試其對抗BAW、CEW與CL之能力。有關結果之報導，使用“**BAW、CEW & CL**分級表”(參見表格部分)。

對**BAW**進行之生物分析

【0216】對BAW之生物分析係使用128孔之食物盤分析進行。將一至五隻第二齡期之BAW幼蟲置於食物盤之每一孔(3毫升)，此食物盤已事先填充1毫升之人工食物，已施加 $50 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ 之測試分子(溶於 $50 \mu\text{L}$ 之90：10丙酮-水之混合物)(至八個孔之每一者)，之後讓其乾燥。盤係以一透明自黏性覆蓋物覆蓋，且於 25°C ，14：10亮-暗下保持五至七天。記錄每一孔之幼蟲死亡率百分比；接著將八個孔中之活性求平均值。結果在標題為「表**ABC**：生物分析結果」(參見表格部分)之表中示出。

對**CL**進行之生物分析

【0217】對CL之生物分析係使用128孔之食物盤分析進行。將一至五隻第二齡期之CL幼蟲置於食物盤之每一孔(3毫升)，此食物盤已事先填充1毫升之人工食物，已施加 $50 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ 之測試分子(溶於 $50 \mu\text{L}$ 之90：10丙酮-水之混合物)(至八個孔之每一者)，之後讓其乾燥。盤係以一透

明自黏性覆蓋物覆蓋，且於25 °C，14：10亮-暗下保持五至七天。記錄每一孔之幼蟲死亡率百分比；接著將八個孔中之活性求平均值。結果在標題為「表**ABC**：生物分析結果」(參見表格部分)之表中示出。

實施例**B**：對碧桃蚜蟲(**GREEN PEACH APHID**)(桃蚜(*Myzus persicae*), **MYZUPE**) (“**GPA**”)進行之生物分析.

【0218】GPA為桃樹最重要之蚜蟲害蟲，其導致生長減少、葉子枯萎及各種組織死亡。其亦因為作用為輸送植物病毒的載體而為有害，諸如將馬鈴薯病毒Y與馬鈴薯捲葉病毒(potato leafroll virus)輸送至顛茄/馬鈴薯科即茄科(nightshade/potato family *Solanaceae*)的成員，及將各種嵌紋病毒輸送至其他糧食作物。GPA侵襲諸如以下之植物：青花菜、牛蒡、甘藍、胡蘿蔔、花椰菜、蘿蔔(daikon)、茄子、青豆、萵苣、澳洲胡桃(macadamia)、木瓜、胡椒、甘薯、番茄、水芥(watercress)及西葫蘆(zucchini)以及其他作物。GPA亦侵襲多種觀賞性作物，諸如康乃馨、菊花、白花甘藍(flowering white cabbage)、一品紅及玫瑰。GPA已對於多種殺蟲劑產生抗藥性。因此，基於上述因素，此害蟲之控制係重要的。而且，控制此已知為取食汁液害蟲之害蟲(GPA)之分子，可用於控制其他取食植物汁液之害蟲。

【0219】本文件中揭示之某些分子係使用下列實施例中所述之程序，來測試其對抗GPA之能力。有關結果之報導，使用“**GPA & YFM**分級表”(參見表格部分)。

【0220】將在3英吋盆中生長之具有2-3片小(3-5cm)真葉之甘藍幼苗用作測試基材。在化學品施用前一天，用20-50隻GPA(無翅成蟲及若蟲階段)侵害該等幼苗。針對各次處理使用四個具有個別幼苗之盆。將測試分子(2mg)溶解於2mL丙酮/甲醇(1：1)溶劑中，形成1000 ppm測試分子之儲備溶液。將儲備溶液用含0.025%妥文(Tween 20)之水稀釋5x，得到200ppm測試分子之溶液。用手持抽吸型噴霧器將溶液噴至甘藍葉子之兩面直至徑流。用僅含有20體積%丙酮/甲醇(1：1)溶劑之稀釋劑對參考植物(溶劑檢查)進行噴霧。評級前，經處理之植物在約25 °C及環境相對濕度(RH)之貯存室中置放三天。藉由在顯微鏡下計數每株植物上活蚜蟲之數目來進行評估。藉由使用如下所示之阿博特氏(Abbott's)校正公式(W.S. Abbott, "A Method of Computing the Effectiveness of an Insecticide" J. Econ. Entomol. 18 (1925)，第265-267頁)來量測控制百分比。

$$\text{經校正之控制}\% = 100 * (X - Y) / X$$

其中

X=溶劑檢查植物上之活蚜蟲數目，及

Y=經處理植物上之活蚜蟲數目

【0221】結果在標題為「表ABC：生物分析結果」(參見表格部分)之表中示出。

實施例C：對黃熱病蚊(埃及斑蚊(*Aedes aegypti*，AEDSAE) (“YFM”)))進行之生物分析。

【0222】YFM喜歡在白天叮咬人類，且最常在人類居住處或附近被發現。YFM為傳播數種疾病之媒介。YFM為一種可傳播登革熱與黃熱病毒之蚊子。黃熱病是第二危險之蚊子傳播疾病，僅次於瘧疾。黃熱病為急性病毒出血性疾病，且未接受治療之嚴重病患至多有高達50%會死於黃熱病。預計每年全球會有200,000個黃熱病病例，導致30,000人死亡。登革熱是一種討厭的病毒性疾病；由於其會產生劇烈疼痛，所以有時稱為"關節痛熱"或"心臟痛熱"。登革熱每年造成約20,000人死亡。因此，基於上述因素，此害蟲之控制係重要的。而且，控制此已知為吸食性害蟲之害蟲(YFM)之分子，可用於控制造成人類與動物患病的其他的害蟲。

【0223】本文件中揭示之某些分子係使用下列實施例中所述之程序，來測試其對抗YFM之能力。有關結果之報導，使用“GPA & YFM分級表”(參見表格部分)。

【0224】使用含有400 μ g分子，其溶於100 μ L二甲基亞砷(DMSO)中(相當於4000 ppm溶液)之主盤。組合的分子之主盤每孔含有15 μ L。在此盤中，每孔加入135 μ L之90:10水/丙酮混合物。機器人(Biomex® NXP Laboratory Automation Workstation)設定程式由主盤中分配15 μ L吸取液至空的96-孔淺盤中(“子”盤)。每主盤產生6 reps(“子”盤)。產生之“子”盤之後立即經YFM幼蟲感染。

【0225】在該盤處理前一日，將蚊子卵置於含有肝粉末之Millipore水中以開始孵化(4 g.至400 mL中)。在使用

機器人製備“子”盤後，以220 μ L肝粉末/蚊幼蟲混合物(約1天大的幼蟲)感染子盤。該盤經蚊幼蟲感染後，使用非揮發性的上蓋覆蓋該盤，以降低乾燥情況。盤於室溫下維持3天，之後予以分級。3天後，觀察每一孔並依據死亡率評分。結果在標題為「表ABC：生物分析結果」(參見表格部分)之表中示出。

農業上可接受的酸加成鹽類、鹽類衍生物、溶劑合物、酯類衍生物、多形體、同位素與放射性核種

【0226】式1分子可以調配成農業上可接受的酸加成鹽類。作為非限制性例子，胺官能基可與氫氯酸、氫溴酸、硫酸、磷酸、乙酸、苯甲酸、檸檬酸、丙二酸、水楊酸、蘋果酸、福馬酸、草酸、琥珀酸、酒石酸、乳酸、葡萄糖酸、抗壞血酸、馬來酸、天冬門酸、苯磺酸、甲磺酸、乙磺酸、羥甲磺酸，及羥乙磺酸形成鹽類。另外，作為非限制性例子，酸官能基可形成鹽類，包括自鹼金屬或鹼土金屬衍生及自氨及胺衍生者。陽離子之較佳例子可包括鈉、鉀，及鎂。

【0227】式1分子可以調配成鹽衍生物。作為非限制性例子，鹽衍生物可藉由使游離鹼與足夠量之所欲酸接觸產生鹽而製備。游離鹼可藉由將此鹽以適合的稀釋鹼水溶液處理而再生，鹼水溶液諸如稀釋的氫氧化鈉、碳酸鉀、氨，及碳酸氫鈉水溶液。作為許多案例中之範例，一種殺蟲劑如2,4-D，可藉由將其轉化為其二甲基胺鹽類而更具水溶性。

【0228】式1分子可以與溶劑調配成穩定的錯合物，從而使該錯合物在移除未錯合的溶劑後仍保持完整。此等錯合物通常被稱為「溶劑合物」。然而，較佳以水作為溶劑形成穩定的水合物。

【0229】式1分子可製備為酯類衍生物。這些酯類衍生物繼而可以類似於本文件揭示之分子的應用方式應用。

【0230】式1分子可製備為各種結晶性多形體。多形性於發展農用化學品上係重要的，因為相同分子之不同結晶多形體或結構具有不同的物理性質及生物效能。

【0231】式1分子可以用不同的同位素來製造。尤其重要的為具有 ^2H (亦稱為氘)或是 ^3H (亦稱為氚)取代 ^1H 之分子。式1分子可以用不同的放射性核種來製造。尤其重要的為具有 ^{14}C 之分子。具有氘、氚、或是 ^{14}C 取代之式1分子可以使用於生物研究，能夠追蹤化學及物理製程及半衰期研究，以及MoA研究。

立體異構物

【0232】式1分子可以以一種或多種立體異構物形式存在。因此，一定的分子可以外消旋混合物形式生產。熟習此項技術者將瞭解，一種立體異構物可比其他立體異構物更具活性。個別立體異構物可藉由已知的選擇性合成程序獲得、使用經解析之起始物質藉由習知合成程序獲得，或是藉由習知解析程序來獲得。此文件中揭示之一定的分子可以兩種或兩種以上異構物形式存在。各種異構物包括幾何異構物、非鏡相異構物，及鏡相異構物。因此，此文

件中揭示之分子包括幾何異構物、外消旋混合物、個別立體異構物，及光學活性混合物。熟習此項技術者將瞭解，一種異構物可比其他異構物更具活性。本揭示中揭露之結構，為了清楚之故，係僅以一種幾何形式繪製，但是意欲表示該分子之所有幾何形式。

組合

【0233】 在本發明之另一個具體例中，式1分子可與一種或多種活性成分組合使用(諸如，呈組成混合物之形式，或同時或依序施用)。

【0234】 在本發明之另一個具體例中，式1分子可與一種或多種活性成分組合使用(諸如，呈組成混合物之形式，或同時或依序施用)，該活性成分每一者皆具有與式1分子之MoA相同、類似但是更可能為-相異之MoA。

【0235】 在另一個具體例中，式1分子可與一種或多種分子組合使用(諸如，呈組成混合物之形式，或同時或依序施用)，該一種或多種分子具有殺蜚蟊、殺藻、殺卵、殺菌、殺真菌、除草、殺昆蟲、殺軟體動物、殺線蟲、滅鼠及/或殺病毒特性。

【0236】 在另一個具體例中，式1分子可與一種或多種分子組合使用(諸如，呈組成混合物之形式，或同時或依序施用)，該一種或多種分子為拒食劑、驅鳥劑、化學絕育劑、除草劑安全劑、誘蟲劑、驅蟲劑、驅哺乳動物劑、交配干擾劑、植物活化劑、植物生長調節劑及/或協力劑。

【0237】 在另一個具體例中，式1分子可與一種或多

種生物性殺蟲劑組合使用(諸如，呈組成混合物之形式，或同時或依序施用)。

【0238】在另一個具體例中，式1分子與活性成分之殺蟲組成物組合可以廣大變化範圍之重量比使用。舉例而言，二組分混合物，式1分子比活性成分之重量比可以為從約100:1至約1:100；在另一個實施例中，重量比可以為從約50:1至約1:50；；在另一個實施例中，重量比可以為從約20:1至約1:20；在另一個實施例中，重量比可以為從約10:1至約1:10；在另一個實施例中，重量比可以為從約5:1至約1:5；在另一個具體例中，重量比可以為從約3:1至約1:3；在另一個實施例中，重量比可以為從約2:1至約1:2；以及在最後的實施例中，重量比可以為從約1:1(見表B)。然而，一般而言，重量比小於約10:1至約1:10為較佳的。有時使用包含一種三或四組分的混合物亦為較佳的，該混合物包含式1分子及一種或更多種活性成分。

表B

式 1 分子：活性成分之重量比
100:1 至 1:100
50:1 至 1:50
20:1 至 1:20
10:1 至 1:10
5:1 至 1:5
3:1 至 1:3
2:1 至 1:2
1:1

【0239】式1分子與一種活性成分之重量比亦可以描述為***X*:*Y***；其中***X***為式1之分子之重量份且***Y***為活性成分之重量份。***X***重量份之數值範圍為 $0 < X \leq 100$ 且***Y***重量份之數值範圍為 $0 < Y \leq 100$ ，以及通過圖表顯示於表C中。作為非限制性實例，式1之分子與一種活性成分之重量比範圍可以為20:1。

表 C

活性成分(<i>Y</i>)之重量份	100	<i>X, Y</i>		<i>X, Y</i>			<i>X, Y</i>			
	50	<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>			<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>		
	20	<i>X, Y</i>		<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>		<i>X, Y</i>		<i>X, Y</i>	
	15	<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>					<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>
	10	<i>X, Y</i>		<i>X, Y</i>						
	5	<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>				<i>X, Y</i>		
	3	<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>		<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>		<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>
	2	<i>X, Y</i>		<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>		<i>X, Y</i>		<i>X, Y</i>	
	1	<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>	<i>X, Y</i>
		1	2	3	5	10	15	20	50	100
式1分子 (<i>X</i>)之重量份										

【0240】式1分子與一種活性成分之重量比範圍可以描述為***X*₁ : *Y*₁**至***X*₂ : *Y*₂**，其中***X***及***Y***如上文所定義。

【0241】在一個具體例中，重量比範圍可為***X*₁ : *Y*₁**至***X*₂ : *Y*₂**，其中***X*₁ > *Y*₁**且***X*₂ < *Y*₂**。作為非限制性實例，式1分子與一種活性成分之重量比範圍可在約3 : 1與約1 : 3之

間，含括端點。

【0242】在另一個具體例中，重量比範圍可為 $X_1 : Y_1$ 至 $X_2 : Y_2$ ，其中 $X_1 > Y_1$ 且 $X_2 > Y_2$ 。作為非限制性實例，式1分子與一種活性成分之重量比範圍可在約15：1與約3：1之間，含括端點。

【0243】在另一個具體例中，重量比範圍可為 $X_1 : Y_1$ 至 $X_2 : Y_2$ ，其中 $X_1 < Y_1$ 且 $X_2 < Y_2$ 。作為非限制性實例，式1分子與一種活性成分之重量比範圍可在約1：3與約1：20之間，含括端點。

調配物

【0244】殺蟲劑很少會適合以單純形式使用。通常需要添加其他物質，以便該殺蟲劑能以允許方便施用、處理、輸送、儲存及最大殺蟲劑活性之所需濃度及適宜形式使用。因此，殺蟲劑係調配成例如餌劑、濃縮乳劑、粉劑、可乳化性濃縮液、煙蒸劑、膠劑、粒劑、微膠囊、種子處理劑、懸浮濃縮劑、懸乳劑(suspension)、錠劑、水溶性液劑、水分散性粒劑或是乾燥可流動劑、可濕性粉劑及超低體積溶液。

【0245】殺蟲劑最經常以由此等殺蟲劑的濃縮調配物所製備之含水懸浮液或乳劑的形式來施用。此等水溶性、水可懸浮或可乳化調配物為固體，通常稱為可濕性粉末、水可分散顆粒，或者為液體，通常稱為可乳化濃縮物或水性懸浮液。可濕性粉末，其可經壓緊以形成水可分散顆粒，包含殺蟲劑、載劑及界面活性劑之緊密混合物。殺

蟲劑之濃度通常為約10重量%至約90重量%。載劑通常選自鎂鋁海泡石黏土(attapulgite clay)、蒙脫石黏土(montmorillonite clay)、矽藻土(diatomaceous earth)或純化矽酸鹽。包含約0.5%至約10%的可濕性粉劑之有效界面活性劑，見於磺酸化木質素、縮合萘磺酸鹽、萘磺酸鹽、烷基苯磺酸鹽、烷基硫酸鹽以及非離子性界面活性劑，諸如烷基苯酚的環氧乙烷加成物。

【0246】殺蟲劑之可乳化濃縮物包含溶解於載劑中合宜濃度之殺蟲劑，諸如每公升液體約50至約500公克，該載劑為水可混溶的溶劑或水不混溶的有機溶劑及乳化劑之混合物。適用的有機溶劑包括芳族類，尤其是二甲苯類與石油分餾物，尤其是石油的高沸點萘與烯烴部分，諸如重芳族石油腦。亦可使用其他有機溶劑，諸如包括松香衍生物在內之萜烯溶劑、脂族酮類諸如環己酮，及複合醇類諸如2-乙氧基乙醇。用於可乳化性濃縮液之適宜乳化劑係選自習用的陰離子性及非離子性界面活性劑。

【0247】水性懸浮液包含以在約5重量%至約50重量%範圍內之濃度，分散在水性載劑中之非水溶性殺蟲劑的懸浮液。懸浮液藉由以下方式製備：精細研磨殺蟲劑並將其劇烈混合至載劑中，該載劑包含水及界面活性劑。亦可添加諸如無機鹽及合成膠或天然膠之成分，從而增加水性載劑之密度及黏度。通常最有效的為藉由以儀器，諸如砂磨機、球磨機或活塞型均質器中製備水性混合物並對其進行均質化來同時研磨及混合殺蟲劑。

【0248】殺蟲劑亦可以顆粒組成物之形式來施用，該等顆粒組成物尤其適用於施用至土壤中。顆粒組成物通常含有約0.5重量%至約10重量%之殺蟲劑分散在載劑中，該載劑包含黏土或相似物質。該等組成物通常藉由以下方式製備：將該殺蟲劑溶解在適合之溶劑中並將其施用至顆粒載劑上，該顆粒載劑已經預成形為適當粒徑，在約0.5至約3mm範圍內。此等組成物亦可藉由以下方式調配：將該載劑及分子製成麵團狀或糊狀，且壓碎並乾燥，從而得到所需顆粒粒徑。

【0249】含有殺蟲劑之塵劑係藉由以下方式製備：將呈粉末形式之殺蟲劑與適合之粉塵狀農業載劑，諸如高嶺黏土、經研磨火山岩及其類似載劑，緊密混合。塵劑可適當地含有約1%至約10%的殺蟲劑。塵劑可以施用作為拌種 (seed dressing) 或以粉塵鼓風機施用於葉片上。

【0250】同樣可行的是以配於適當有機溶劑中的溶液形式施用之殺蟲劑，該有機溶劑通常為石油諸如噴霧油，該有機溶劑廣泛用於農業化學。

【0251】殺蟲劑亦可以氣溶膠組成物之形式來施用。在此等組成物中，將殺蟲劑溶解或分散在載劑中，該載劑為產生壓力之推進劑混合物。將氣溶膠組成物包裝在容器中，該混合物經由霧化閥而自該容器噴散。

【0252】當將殺蟲劑與食物或引誘劑或兩者混合時，形成殺蟲劑誘餌。當害蟲吃掉誘餌時，其等亦攝入殺蟲劑。誘餌可呈顆粒、凝膠、可流動粉末、液體或固體形

式。誘餌可用於害蟲藏身處。

【0253】薰蒸劑為具有相對較高蒸氣壓之殺蟲劑，且因此可以濃度足以殺死土壤或密封空間中之害蟲的氣體形式存在。薰蒸劑之毒性與其濃度及曝露時間成比例。其等特徵在於具有良好的擴散能力，並藉由滲透至害蟲之呼吸系統中或經由害蟲之表皮吸收而起作用。施用薰蒸劑以便在氣密房間或建築物中或在專門腔室中，對防氣片(gas proof sheet)下之儲藏產品害蟲進行控制。

【0254】可藉由將殺蟲劑粒子或小滴懸浮在各種類型之塑膠聚合物中，而將殺蟲劑微膠囊化。藉由改變聚合物之化學性質或藉由改變加工中之因素，可形成各種大小、溶解度、壁厚度及滲透度之微膠囊。此等因素控制其中活性成分之釋放速度，而釋放速度又影響產品之殘留效能、作用速度及氣味。

【0255】油溶液濃縮物係藉由將殺蟲劑溶於一溶劑內而製備，該溶劑會將殺蟲劑留置於溶液中。殺蟲劑之油溶液由於溶劑本身具有殺蟲作用及溶解體被之蠟質覆蓋物而增加殺蟲劑的攝取速度，所以通常會提供比其他調配物更快的擊倒及殺死害蟲作用。油溶液之其他優點包括較好的儲藏穩定性、更好的裂縫滲透性及更好的油膩表面黏附性。

【0256】另一具體例為一種水包油型乳劑，其中該乳劑包含油性小球，該等油性小球各自提供有層狀液晶塗層，並分散在水相中，其中各油性小球包含至少一種具有

農業活性之分子，並個別地塗佈有單層狀或寡層狀之層，該層包含：(1)至少一種非離子性親脂性界面活性劑，(2)至少一種非離子性親水性界面活性劑，及(3)至少一種離子性界面活性劑，其中該等小球具有小於800奈米之平均粒徑。

其他調配物組分

【0257】一般而言，當式1揭示之分子使用於一調配物中時，此調配物亦可含有其他組分。此等組分包括但不限於(其係一個非詳盡無遺及非互相排除的清單)濕潤劑、展佈劑、黏著劑、滲透劑、緩衝劑、螯合劑、漂浮降低劑、相容劑、消泡劑、清潔劑及乳化劑。現即說明一些組分。

【0258】潤濕劑為當添加至一液體時，藉由降低該液體與其展佈表面之間的界面張力而增加該液體的展佈或滲透力的物質。潤濕劑用於農業化學調配物中之兩種主要功能：在處理及製造期間增加粉末在水中之潤濕速率，從而製造可溶性液體之濃縮物或懸浮濃縮物；及在產品與水在噴霧罐中混合期間降低可濕性粉末之潤濕時間，並使水滲透進入水可分散顆粒中的情況改善。用於可濕性粉末、懸浮濃縮物及水可分散顆粒調配物中的潤濕劑之實例為：月桂基硫酸鈉；二辛基磺基丁二酸鈉；烷基酚乙氧化物；及脂族醇乙氧化物。

【0259】分散劑為吸附至粒子表面上且有助於保持粒子之分散狀態以及防止粒子重新聚集的物質。將分散劑添加至農業化學調配物中以有助於製造期間之分散及懸

浮，並且有助於確保粒子在噴霧罐中重新分散至水中。其等廣泛用於可濕性粉末、懸浮濃縮物及水可分散顆粒中。用作分散劑之界面活性劑具有牢固吸附至粒子表面上之能力，並對粒子重新聚集提供電荷或空間障壁。最常用的界面活性劑為陰離子型、非離子型或該等兩種類型之混合物。對於可濕性粉末調配物，最常用分散劑為木質素磺酸鈉。對於懸浮濃縮物而言，使用聚電解質，諸如鈉-萘磺酸鹽-甲醛-濃縮物來得到極好的吸附及穩定。亦使用三苯乙烷基苯酚乙氧化物磷酸酯。非離子物，諸如烷基芳基氧化乙烯濃縮物及EO-PO嵌段共聚物，有時與陰離子物組合起來作為用於懸浮濃縮物之分散劑。近年來，新型式之極高分子量聚合物界面活性劑已開發作為分散劑。此等具有極長之疏水性『主鏈』及大量氧化乙烯鏈，其形成『梳狀』界面活性劑之『齒』。此等高分子量聚合物可對懸浮濃縮物產生極好的長期穩定性，因為疏水性主鏈對粒子表面具有許多錨定點。用於農業化學調配物之分散劑之實例為：木質素磺酸鈉；萘磺酸鈉甲醛濃縮物；三苯乙烷基苯酚-乙氧化物-磷酸-酯；脂族醇乙氧化物；烷基乙氧化物；EO-PO嵌段共聚物；以及接枝共聚物。

【0260】 乳化劑為使一種液相之液滴於另一液相中之懸浮液穩定之物質。在無乳化劑之情況下，兩種液體會分離成兩個不混溶的液相。最常用的乳化劑摻合物含有具有12個或12個以上環氧乙烷單元之烷基酚或脂族醇，及十二烷基苯磺酸之油溶性鈣鹽。範圍在8至18的親水親油平

衡(「HLB」)值通常會提供良好穩定之乳液。乳液穩定性有時可藉由添加少量EO-PO嵌段共聚物界面活性劑來改進。

【0261】增溶劑為在濃度超過臨界微胞濃度時，在水中形成微胞之界面活性劑。接著，微胞能夠溶解(dissolve)或溶解(solubilize)微胞之疏水部分內之水不溶性物質。通常用於溶解作用之界面活性劑類型為非離子型、脫水山梨糖醇單油酸酯、脫水山梨糖醇單油酸酯乙氧化物及油酸甲酯。

【0262】界面活性劑有時單獨使用，或與其他添加劑，諸如作為佐劑之礦物油或植物油，一起使用於噴霧罐混合物，以改進殺蟲劑對目標之生物效能。用於生物增強之界面活性劑類型通常視殺蟲劑之性質及作用模式而定。然而，其等通常為非離子物，諸如：烷基乙氧化物；線性脂族醇乙氧化物；脂族胺乙氧化物。

【0263】農業調配物中的載劑或稀釋劑為添加至殺蟲劑中以得到所需強度產品之物質。載劑通常為具有較高吸收能力之物質，而稀釋劑通常為具有較低吸收能力之物質。載劑及稀釋劑係使用於塵劑、可濕性粉末、顆粒及水可分散顆粒之調配物。

【0264】有機溶劑主要用於可乳化濃縮物、水包油乳液、懸乳劑及超低體積調配物之調配，及在較少程度上用於顆粒調配物。有時使用溶劑的混合物。第一主要群組之溶劑為脂族石蠟油，諸如煤油或精製石蠟。第二主要群組

(且最常見)包含芳族溶劑，諸如二甲苯及較高分子量之C9及C10芳族溶劑之餾份。當將調配物乳化至水中時，氯化烴係使用作防止殺蟲劑結晶之共溶劑。醇類有時用作共溶劑以增強溶劑功效。其他溶劑可包括植物油、種子油及植物油與種子油之酯類。

【0265】增稠劑或膠凝劑主要用於懸浮濃縮物、乳液及懸乳劑之調配物，以改變液體之流變學或流動性質及防止分散粒子或液滴分離及沈降。增稠劑、膠凝劑及抗沈降劑通常屬於兩種類別，亦即水不溶性微粒及水溶性聚合物。可使用黏土及二氧化矽來製造懸浮濃縮物調配物。此等物質類型之實例包括但不限於，蒙脫石、膨潤土、矽酸鎂鋁及鎂鋁海泡石。水溶性多醣類多年來已用作增稠-膠凝劑。最常用之多醣類型為種子及海藻之天然萃取物或纖維素之合成衍生物。此等類型物質之實例包括但不限於，瓜爾膠；刺槐豆膠；角叉菜膠；海藻酸鹽；甲基纖維素；羧甲基纖維素鈉(SCMC)；羥乙基纖維素(HEC)。其他類型的抗沈降劑係以改質澱粉、聚丙烯酸酯、聚乙烯醇及聚氧化乙烯為基。另一種良好的抗沈降劑為三仙膠。

【0266】微生物會導致調配產品之腐敗。因此，使用防腐劑來消除或降低其等之作用。此等試劑之實例包括但不限於：丙酸及其鈉鹽；山梨酸及其鈉或鉀鹽；苯甲酸及其鈉鹽；對羥基苯甲酸鈉鹽；對羥基苯甲酸甲酯；及1,2-苯并異噻唑啉-3-酮(BIT)。

【0267】界面活性劑之存在，經常造成水基調配物在

製造及經由噴灑槽施用時在混合操作期間起泡。為了減少起泡之傾向，通常在製造階段期間或裝填至瓶中之前添加消泡劑。通常存在有兩種類型的消泡劑，亦即聚矽氧以及非聚矽氧。聚矽氧通常為二甲基聚矽氧烷之水性乳液，而非聚矽氧消泡劑為水不溶性油，諸如辛醇及壬醇，或二氧化矽。在該兩種情況下，消泡劑之功能為自空氣-水界面中替換界面活性劑。

【0268】「綠色」製劑(例如佐劑、界面活性劑、溶劑)可降低作物保護調配物之整體環境足跡。綠色試劑為生物可降解的，且通常衍生自天然及/或永續來源，例如植物及動物來源。特定實例為：植物油、種子油及其酯類，以及烷氧基化烷基聚葡萄糖苷。

施用

【0269】式1的分子可施用於任何所在地。施用此等分子之特定的作物所在地包括紫花苜蓿、杏仁、蘋果、大麥、豆類、油菜、玉米、棉花、十字花科植物、萵苣、燕麥、橘子、梨、胡椒、馬鈴薯、水稻、高粱、大豆、草莓、甘蔗、甜菜、向日葵、煙草、蕃茄、小麥，和其他有價值的作物生長之所在地或其種子待種植之處。

【0270】式1的分子亦可施用於植物，如作物生長之處，以及可造成此等植物的商業損失的害蟲水平低(甚至並無實際的存在)之區域。此所在地施用此等分子對於此所在地生長的植物為有利的。此等益處可以包括但不限於：協助植物生長出更好的根系；協助植物更佳地承受壓力生長

條件；改進植物健康；改進植物產量(例如增加生物質及/或增加有價值成分之含量)；改進植物活力(例如改進植物生長及/或葉子更綠)；改進植物品質(例如改進某些成分之含量或組成)；以及改進植物對非生物及/或生物脅迫之耐受性。

【0271】在栽種各種植物時，式1的化合物可以與硫酸銨一起施用，因這樣可以提供額外的益處。

【0272】式1分子可以施用於經基因改造以表現特殊性狀，諸如蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)或其他殺昆蟲性毒素，或該等表現除草劑抗性之植物，或是該等具有表現殺昆蟲性毒素、除草劑抗性、營養強化作用或其他任一有利性狀之「堆疊式」外來基因者之植物上、之中或周圍。

【0273】式1分子可施用至待之植物葉子及/或果實部分以控制害蟲。此等分子會直接與害蟲接觸，或害蟲於食用植物或吸取植物汁液時，會攝入此等分子。

【0274】式1分子亦可施用至土壤，且當以此方式施用時，可控制食用根與莖之害蟲。根可吸收此等分子藉此將其送至植物之葉子部分，以控制地面上部嚼食與汁液取食之害蟲。

【0275】可藉由在植物的不同部分施用(例如藉由噴灑一所在地)式1分子，利用殺蟲劑在植物中的系統性移動，而控制位於植物另一部分的害蟲。舉例而言，可藉由滴灌或條施，藉由以例如種植前或種植後之土壤澆灌而處理土壤，或藉由種植前處理植物種子來達成控制食葉昆蟲。

【0276】式1的分子可以與誘餌一起施用。一般而言，在誘餌情況下，將誘餌置於地面，白蟻可與誘餌接觸及/或被吸引。亦可將誘餌施用至建築表面(水平、垂直或傾斜表面)，該處螞蟥、白蟻、蟑螂與蒼蠅，皆會與誘餌接觸及/或被吸引。

【0277】式1分子可囊封在膠囊內、或置放於膠囊表面上。膠囊的大小可在從奈米大小(直徑大約100-900奈米)至微米大小(直徑大約10-900微米)範圍內。

【0278】式1分子可以施用於害蟲之卵。由於一些害蟲之卵具有抗某些殺蟲劑之獨特能力，故可能需要重複施用此等分子以控制新出現之幼蟲。

【0279】式1分子可以施用作為種子處理。可對將發芽之所有類型的種子進行種子處理，包括經遺傳修飾以表現特殊性狀之植物的種子。代表性實例包括對無脊椎動物害蟲，諸如蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)，表現蛋白毒性或其他殺昆蟲毒素者，表現除草劑抗性者，諸如「Roundup Ready」種子，或具有表現殺昆蟲毒素、除草劑抗性、營養增強、抗旱性或任何其他有益特性之「堆疊式」外來基因者。另外，此等使用式1分子之種子處理可進一步增強植物耐嚴苛生長條件的能力更佳。由此產生較健康，較有活力之植物，此在收穫時節可導致更高的產量。一般而言，預期每100,000個種子約1公克至約500公克之此等分子會提供良好的益處，預期每100,000個種子約10公克至約100公克之量會提供最佳的益處，且預期每

100,000個種子約25公克至約75公克之量會提供甚至更佳的益處。

【0280】式1的分子可與土壤改良領域中的一或多種活性成分一起使用。

【0281】式1分子可用於控制獸醫學領域或在非人類動物飼養領域中之內寄生蟲及外寄生蟲。此等分子可以舉例而言藉由，例如錠劑、膠囊、飲料、顆粒形式經口投與，藉由以例如浸泡、噴灑、傾倒、點藥及噴粉形式塗覆皮膚，以及藉由以例如注射劑形式的非經腸投與來施用。

【0282】式1分子亦可有利地用於家畜飼養，例如牛、綿羊、豬、雞、鮭魚及鵝。其等亦可有利地用於寵物，諸如馬、犬及貓。欲控制之特定害蟲將為會對該等動物造成麻煩之跳蚤及壁蝨。適合的調配物與飲用水或飼料一起經口投與該等動物。適合的劑量及調配物視物種而定。

【0283】式1分子亦可用於控制寄生蟲，尤其是上列動物腸道中的寄生蟲。

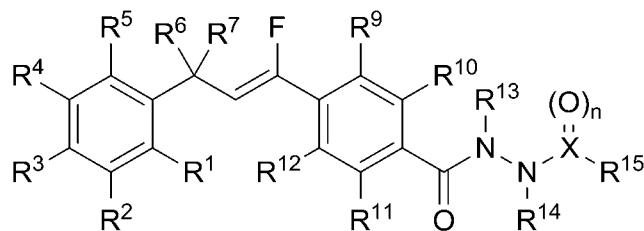
【0284】式1分子亦可用於人類健康照護之治療方法。此等方法包括但不限於，以例如錠劑、膠囊、飲料、顆粒形式經口投與及藉由皮膚施用。

【0285】式1分子亦可施用於侵入性害蟲。全世界之害蟲正遷移至新環境(對於此害蟲而言)，且此後在該新環境中變成新的侵入物種。此等分子亦可用於該等新的侵入物種以在該新環境中對其進行控制。

【0286】因此，根據上述以及表格部分的表格，提供

下列項目。

【0287】 1.一種具下式之分子



式1

其中：

(A) R^1 、 R^5 、 R^6 、 R^{11} 及 R^{12} 各自獨立地選自於下列所構成的群組：H、F、Cl、Br、I、CN、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 鹵烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基，以及 (C_1-C_4) 鹵烷氧基

較佳地， R^1 、 R^5 、 R^6 、 R^{11} 及 R^{12} 為H；

(B) R^2 、 R^3 及 R^4 各自獨立地選自於下列所構成的群組：H、F、Cl、Br、I、CN、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_1-C_4) 鹵烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基，以及 (C_1-C_4) 鹵烷氧基

較佳地， R^2 係選自於下列所構成的群組：Cl、Br或 CH_3 ， R^3 係選自於下列所構成的群組：F、Cl、Br或 $CH=CH_2$ ，以及 R^4 係選自於下列所構成的群組：Cl、Br或 CH_3

還更佳地， R^2 、 R^3 及 R^4 為Cl；

(C) R^7 為 (C_1-C_6) 鹵烷基

較佳地， R^7 為 CF_3 或 CF_2CH_3 ；

(D) R^9 係選自於下列所構成的群組：(F)、H、F、Cl、

Br、I、CN、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基，以及(C₁-C₄)鹵烷氧基

較佳地，**R**⁹為H；

(E) **R**¹⁰係選自於下列所構成的群組：**(F)**、F、Cl、Br、I、CN、(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基，以及(C₁-C₄)鹵烷氧基

較佳地，**R**¹⁰為Cl、Br、I、CH₃或CF₃；

(F) **R**⁹及**R**¹⁰能選擇性地一起形成一個3至5員飽和或不飽和的、烴基(hydrocarbyl)鍵聯，

其中該烴基鍵聯可選擇性地以一個或更多個獨立地選自於下列所構成的群組之取代基予以取代：F、Cl、Br、I及CN；

(G) **R**¹³及**R**¹⁴各自獨立地選自於下列所構成的群組：H、(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基，以及(C₁-C₄)鹵烷氧基

較佳地，**R**¹³或**R**¹⁴為CH₃；

(H) **X**係選自於下列所構成的群組：C、S及P(C₁-C₆)烷基

較佳地，**X**為C或S；

(I) **n**為1或2；

(J) **R**¹⁵係選自於下列所構成的群組：(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷氧基、苯基及NH(C₁-C₄)鹵烷基，

其中各個烷基、烯基、鹵烷基、烷氧基、鹵烷氧基及

苯基可以選擇性地以一個或更多個獨立地選自於下列所構成的群組之取代基予以取代：F、Cl、Br、I、CN及OH

較佳地， R^{15} 為 $CH_2CH_2CF_3$ 或 $NHCH_2CF_3$ ；以及

該式1分子之農業上可接受的酸加成鹽類、鹽類衍生物、溶劑合物、酯類衍生物、結晶性多形體、同位素、解析的立體異構物，以及互變異構物。

2.如1之分子(A molecule according to 1)，其中

(A) R^1 、 R^5 、 R^6 、 R^{11} 及 R^{12} 為H；

(B) R^2 、 R^3 及 R^4 各自獨立地選自於下列所構成的群組：H、F、Cl、Br、I、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基以及 (C_1-C_4) 鹵烷基；

(C) R^7 為 (C_1-C_6) 鹵烷基；

(D) R^9 為H；

(E) R^{10} 係選自於下列所構成的群組：H、F、Cl、Br、I、 (C_1-C_4) 烷基以及 (C_1-C_4) 鹵烷基；

(G) R^{13} 及 R^{14} 各自獨立地選自於下列所構成的群組：H及 (C_1-C_4) 烷基；

(H) X係選自於下列所構成的群組：C及S；

(I) n為1或2；以及

(J) R^{15} 係選自於下列所構成的群組： (C_1-C_4) 鹵烷基及 $NH(C_1-C_4)$ 鹵烷基。

3.如1之分子，其中該分子係選自於表2的該等分子中之一者所構成的群組。

4.如1之分子，其中該分子係選自於表1的該等分子中

之一者所構成的群組。

5. 一種殺蟲組成物，其包含如1、2、3或4中任一者之分子，進一步包含一或更多種活性成分。

6. 如5之殺蟲組成物，其中該活性成分係來自AIGA。

7. 如5之殺蟲組成物，其中該活性成分係選自於下列所構成的群組：**AI-1**、1,3-二氯丙烯、陶斯松(chlorpyrifos)、甲基陶斯松(chlorpyrifos-methyl)、六伏隆(hexaflumuron)、滅芬諾(methoxyfenozide)、多氟脲(noviflumuron)、賜諾特(spinetoram)、賜諾殺(spinosad)、氟啶蟲胺脒(sulfoxaflor)，以及磺醯氟。

8. 一種殺蟲組成物，其包含如1、2、3或4中任一者之分子，其進一步包含一種**MoA**材料。

9. 如7之殺蟲組成物，其中該**MoA**材料係來自**MoAMGA**。

10. 如5、6、7、8或9中任一者之殺蟲組成物，其中如式1之分子與該活性成分之重量比係選自於表B。

11. 一種控制害蟲的方法，該方法包含施用殺蟲有效量的如1、2、3或4中任一者之分子至一所在地。

12. 一種控制害蟲的方法，該方法包含施用殺蟲有效量的如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物至一所在地。

13. 如1、2、3或4中任一者之分子，或如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該分子係呈農業上可接受的酸加成鹽類的形式。

14.如1、2、3或4中任一者之分子，或如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該分子係呈一種鹽類衍生物的形式。

15.如1、2、3或4中任一者之分子，或如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該分子係呈溶劑合物的形式。

16.如1、2、3或4中任一者之分子，或如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該分子係呈一種酯類衍生物的形式。

17.如1、2、3或4中任一者之分子，或如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該分子係呈一種結晶性多形體的形式。

18.如1、2、3或4中任一者之分子，或如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該分子具有氘、氚、及或 ^{14}C 。

19.如1、2、3或4中任一者之分子，或如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該分子係呈一種或更多種立體異構物的形式

20.如1、2、3或4中任一者之分子，或如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該分子係呈一種解析的立體異構物的形式。

21.如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該殺蟲組成物進一步包含另一種活性成分。

22.如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其

中該殺蟲組成物進一步包含還有二種的活性成分。

23. 如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該活性成分具有與該式1分子之MoA不同的一MoA。

24. 如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該殺蟲組成物包含一種活性成分，其具有殺蜚蟊、殺藻、殺卵、殺菌、殺真菌、除草、殺昆蟲、殺軟體動物、殺線蟲、滅鼠及/或殺病毒特性。

25. 如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該殺蟲組成物包含一種活性成分，其為一種拒食劑、驅鳥劑、化學絕育劑、除草劑安全劑、誘蟲劑、驅蟲劑、驅哺乳動物劑、交配干擾劑、植物活化劑、植物生長調節劑及/或協力劑。

26. 如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該殺蟲組成物包含一種活性成分，其為一種生物性殺昆蟲劑。

27. 如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該式1分子比一種活性成分之重量比為100:1至1:100。

28. 如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該式1分子比一種活性成分之重量比為50:1至1:50。

29. 如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該式1分子比一種活性成分之重量比為20:1至1:20

30. 如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該式1分子比一種活性成分之重量比為10:1至1:10。

31. 如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其

中該式1分子比一種活性成分之重量比為5:1至1:5。

32. 如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該式1分子比一種活性成分之重量比為3:1至1:3。

33. 如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該式1分子比一種活性成分之重量比為2:1至1:2。

34. 如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該式1分子比一種活性成分之重量比為1:1。

35. 如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該式1分子比活性成分之重量比係描述為 $X:Y$ ；其中 X 為式1之分子之重量份且 Y 為活性成分之重量份；進一步地其中 X 重量份之數值範圍為 $0 < X \leq 100$ 且 Y 重量份之數值範圍為 $0 < Y \leq 100$ ；以及進一步地其中 X 及 Y 係選自於表C。

36. 如35之殺蟲組成物，其中式1分子比活性成分之重量比範圍係描述為 $X_1:Y_1$ 至 $X_2:Y_2$ ，進一步地其中 $X_1 > Y_1$ 且 $X_2 < Y_2$ 。

37. 如35之殺蟲組成物，其中式1分子比活性成分之重量比範圍係描述為 $X_1:Y_1$ 至 $X_2:Y_2$ ，進一步地其中 $X_1 > Y_1$ 且 $X_2 > Y_2$ 。

38. 如35之殺蟲組成物，其中式1分子比活性成分之重量比範圍係描述為 $X_1:Y_1$ 至 $X_2:Y_2$ ，進一步地其中 $X_1 < Y_1$ 且 $X_2 < Y_2$ 。

39. 如35之殺蟲組成物，其中該組成物為協同性的。

40. 如12之方法，其中該害蟲係來自節肢動物門(Phylum Arthropoda)。

41. 如12之方法，其中該害蟲係來自軟體動物門(Phylum Mollusca)。

42. 如12之方法，其中該害蟲係來自圓形動物門(Phylum Nematoda)。

43. 如12之方法，其中該害蟲為螞蟻、蚜蟲、甲蟲、蠹蟲(bristletails)、蟑螂、蟋蟀、蠮螋(earwigs)、跳蚤、蒼蠅、蚱蜢、葉蟬、蝨(包括海蝨)、蝗蟲、蠕、蛾、線蟲(nematode)、介殼蟲、綜合綱(symphylans)、白蟻、薊馬(thrips)、壁蝨、胡蜂，及/或粉虱。

44. 如12之方法，其中該所在地係紫花苜蓿、杏仁、蘋果、大麥、豆類、油菜、玉米、棉花、十字花科植物、萵苣、燕麥、橘子、梨、胡椒、馬鈴薯、水稻、高粱、大豆、草莓、甘蔗、甜菜、向日葵、煙草、蕃茄、小麥，和其他有價值的作物生長之所在地或其種子待種植之處。

45. 如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，其中該殺蟲組成物進一步包含硫酸銨。

46. 如12之方法，其中該所在地係經遺傳修飾以表現特殊性狀之植物種植之處。

47. 如12之方法，其中該施用係於植物葉子及/或果實部分上實行。

48. 如12之方法，其中該施用係於土壤實行。

49. 如12之方法，其中該施用係藉由滴灌、條施，或是種植前或種植後之土壤澆灌來實行。

50. 如12之方法，其中該施用係於植物葉子及/或果實

部分實行，或是藉由種植前處理植物種子來實行。

51.一種殺蟲組成物，其包含如1、2、3或4中任一者之分子及一種種子。

52. 一種方法，其包含施用如1、2、3或4中任一者之分子，或如5、6、7、8、9或10中任一者之殺蟲組成物，至一種種子。

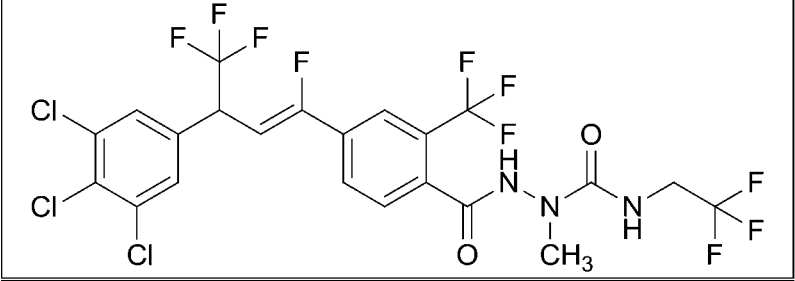
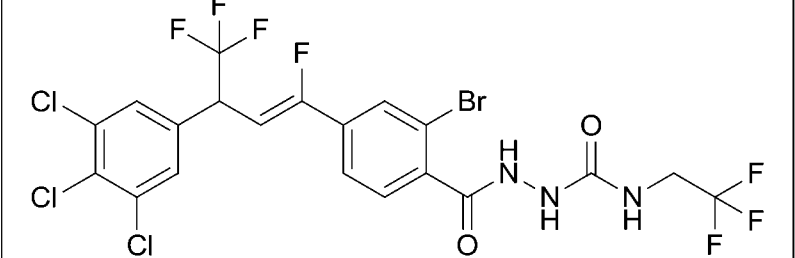
53. 一種方法，其包含施用如1、2、3或4中任一者之分子至包括非人類動物之一所在地，以控制內寄生蟲及/或外寄生蟲。

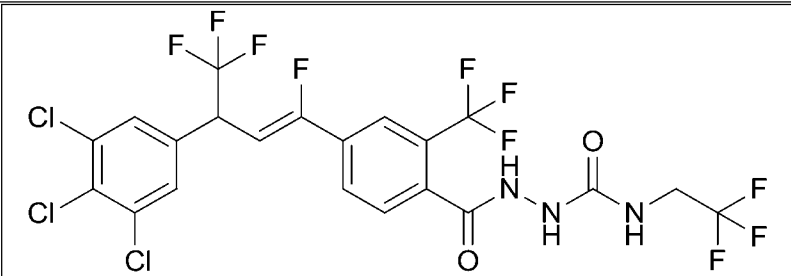
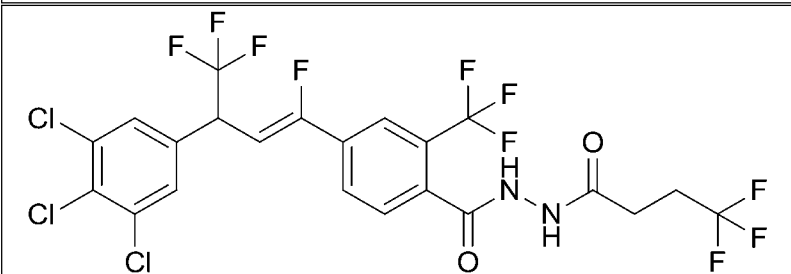
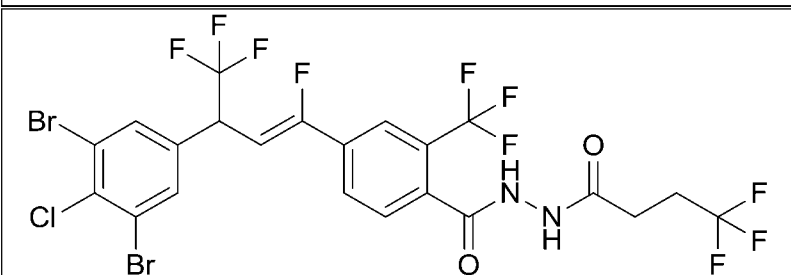
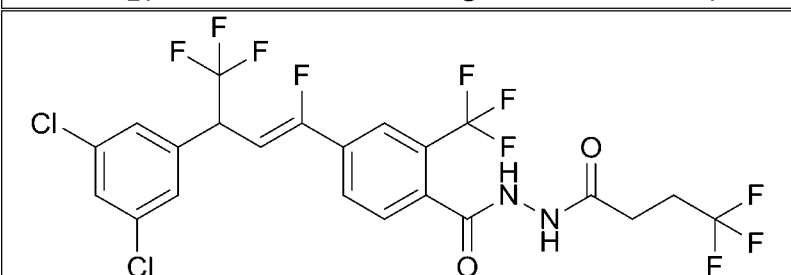
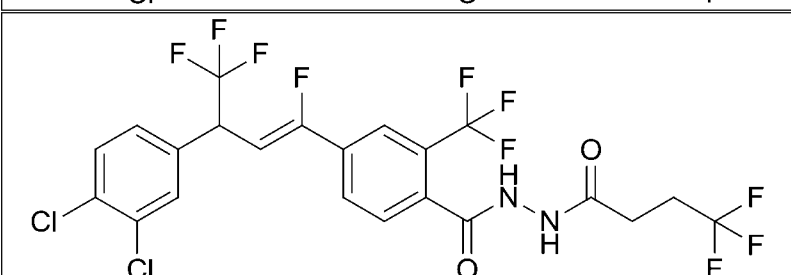
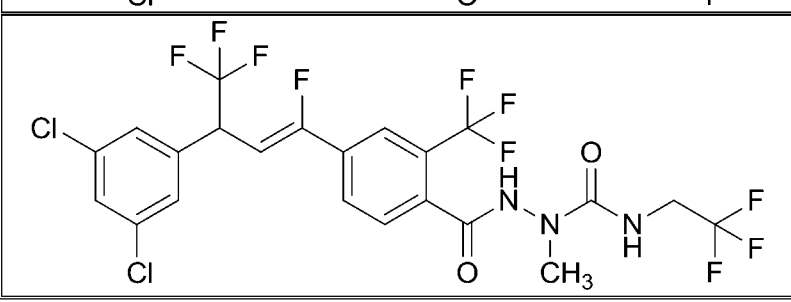
54.一種生產殺蟲組成物之方法，該方法包含混合如請求項1、2、3或4中任一者之分子與一種或更多種活性成分。

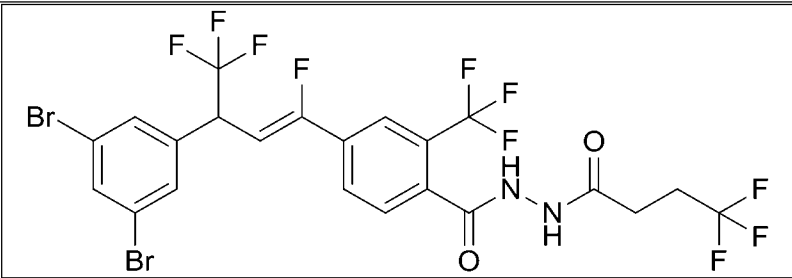
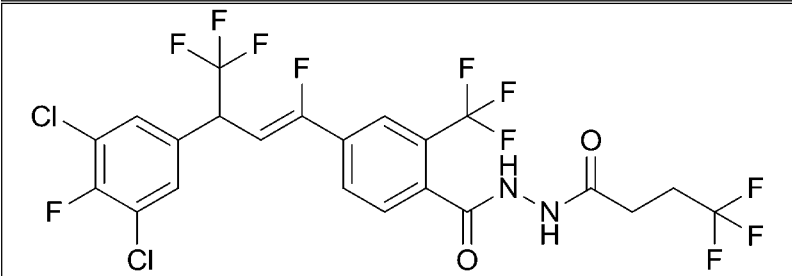
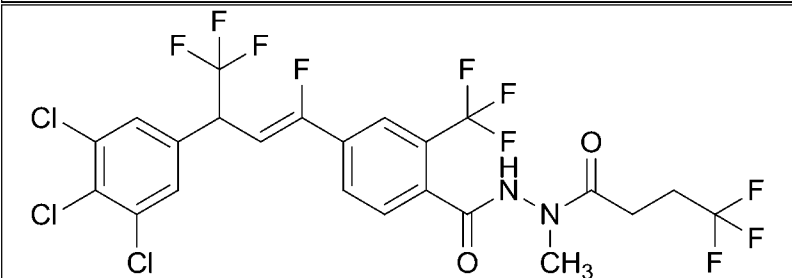
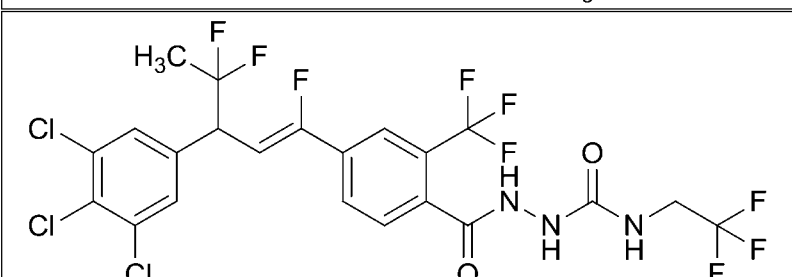
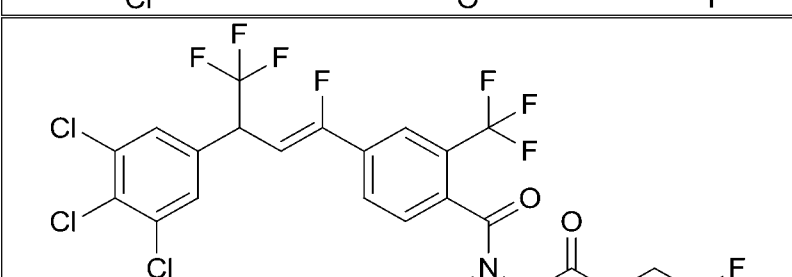
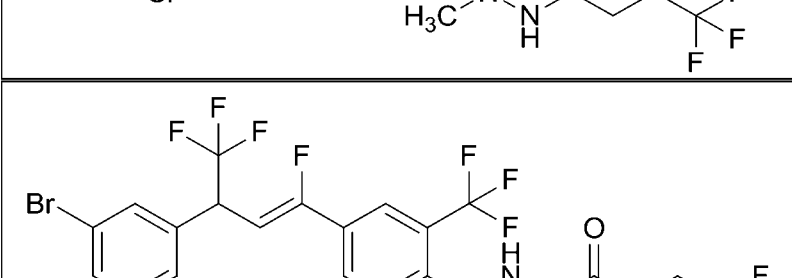
本文件中之標題僅為方便且不能用於解釋本文件之任何部份。

表格部分

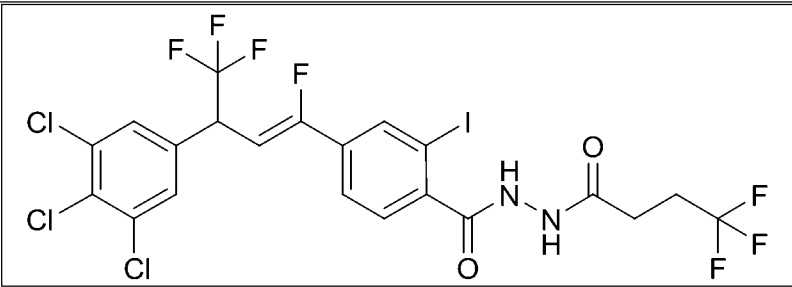
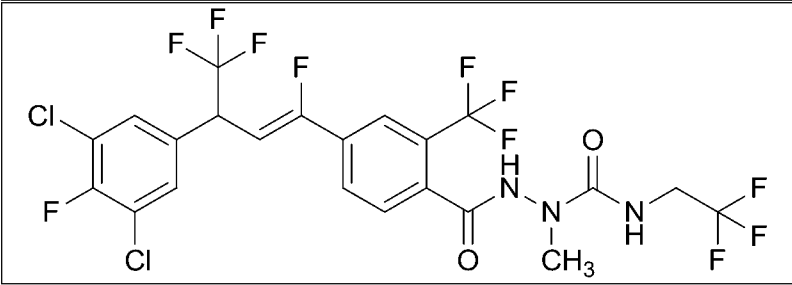
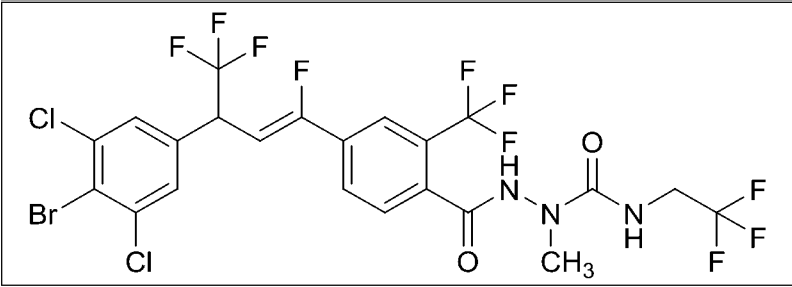
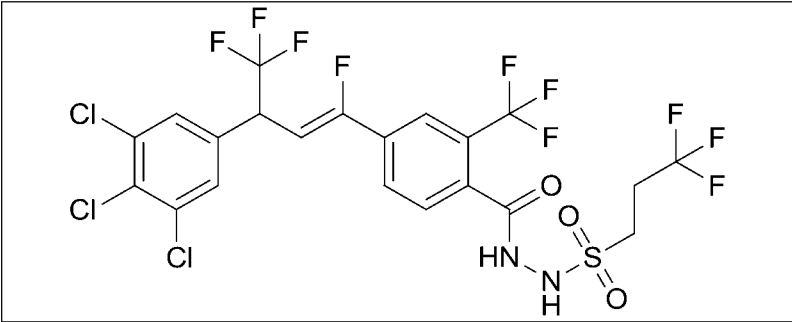
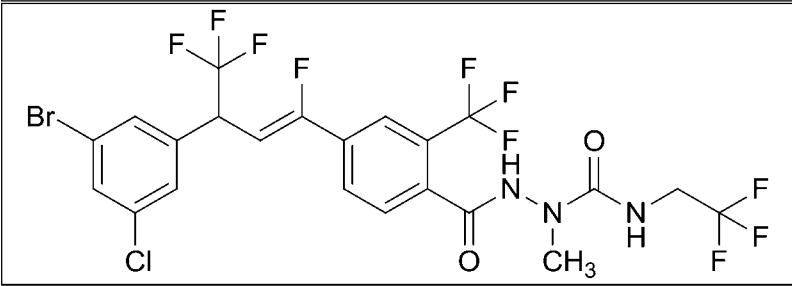
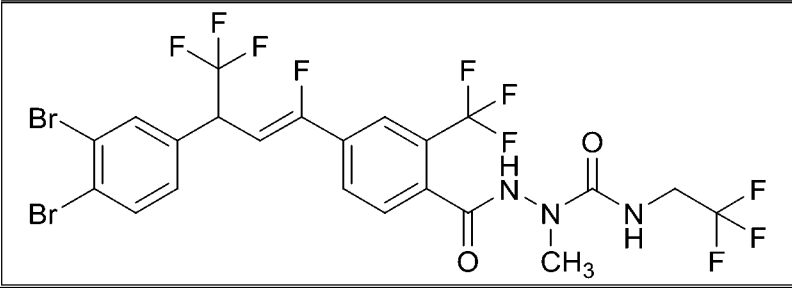
表2. F系列分子之結構和製備方法

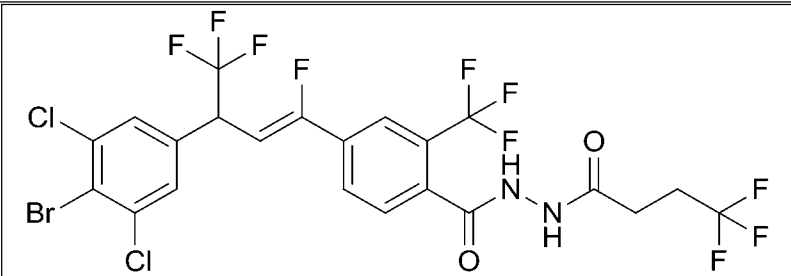
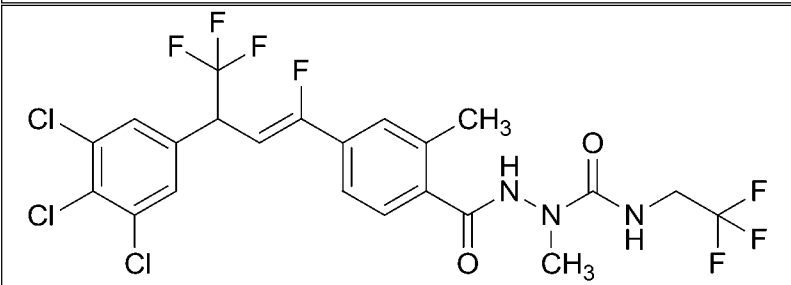
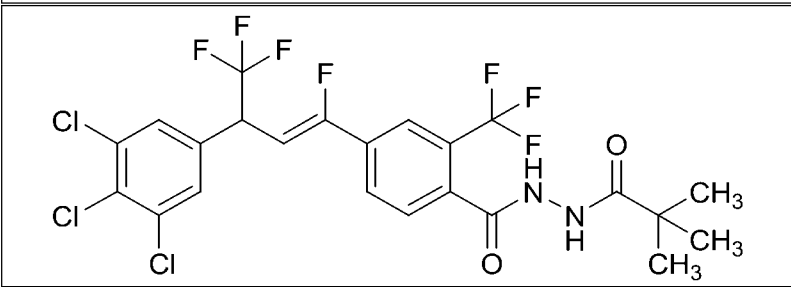
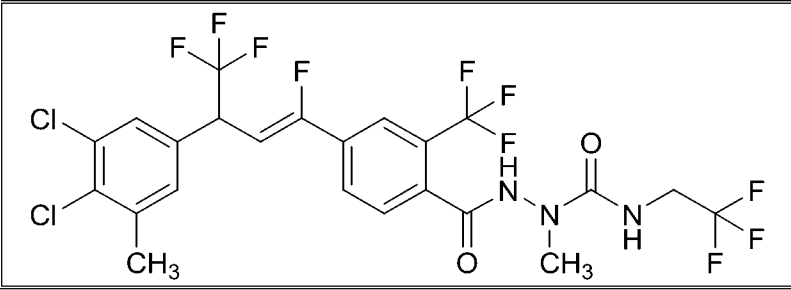
編號	結構	Prep. *
F1		16
F2		13

F3		13
F4		13
F5		14
F6		14
F7		14
F8		14

F9		14
F10		14
F11		13
F12		13
F13		17
F14		15

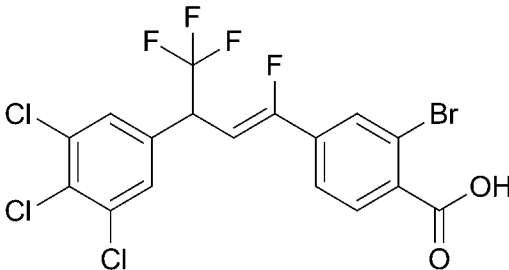
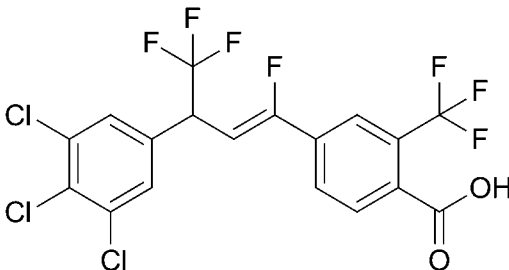
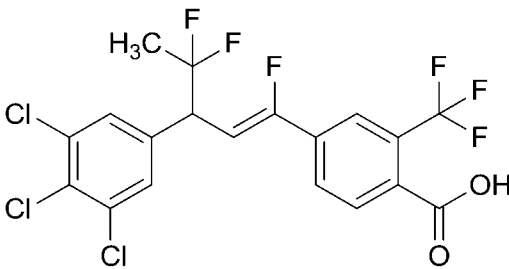
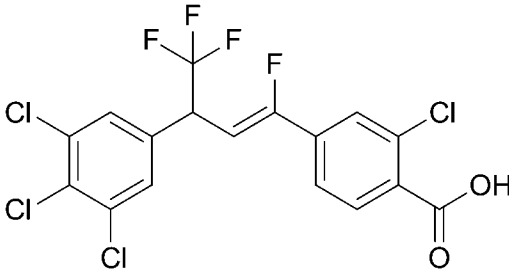
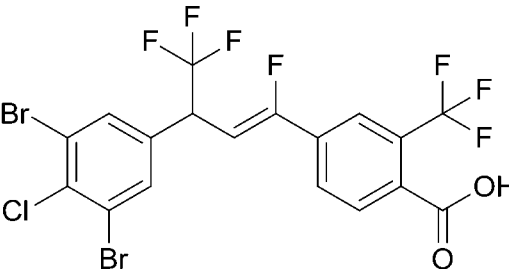
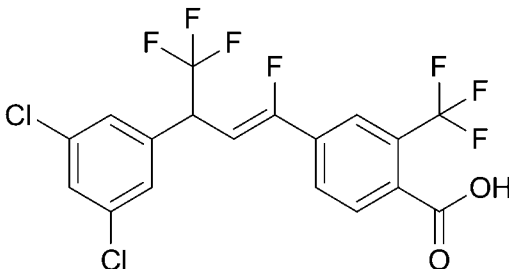
F15	<chem>Clc1cc(Cl)ccc1C(F)(F)C=CC(F)=Cc2ccc(cc2C(F)(F)F)C(=O)N(C)C(=O)NCC(F)(F)F</chem>	14
F16	<chem>Cc1cc(C)c(Cl)cc1C(F)(F)C=CC(F)=Cc2ccc(cc2C(F)(F)F)C(=O)N(C)C(=O)NCC(F)(F)F</chem>	14
F17	<chem>ClC=Cc1cc(Cl)cc(Cl)c1C(F)(F)C=CC(F)=Cc2ccc(cc2C(F)(F)F)C(=O)N(C)C(=O)NCC(F)(F)F</chem>	15
F18	<chem>BrC1=CC(Cl)=CC(Br)=C1C(F)(F)C=CC(F)=Cc2ccc(cc2C(F)(F)F)C(=O)N(C)C(=O)NCC(F)(F)F</chem>	15
F19	<chem>Clc1cc(Cl)cc(Cl)c1C(F)(F)C=CC(F)=Cc2ccc(cc2C(F)(F)F)C(=O)N(C)S(=O)(=O)CC(F)(F)F</chem>	18
F20	<chem>Clc1cc(Cl)cc(Cl)c1C(F)(F)C=CC(F)=Cc2ccc(cc2Cl)C(=O)NCC(=O)NCC(F)(F)F</chem>	13

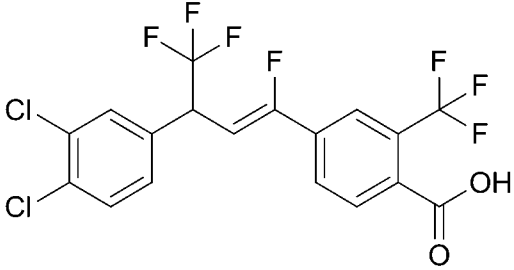
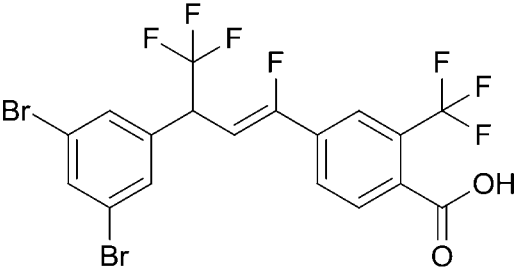
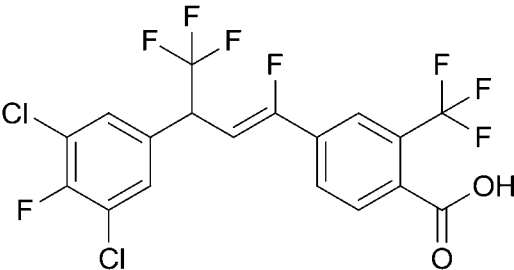
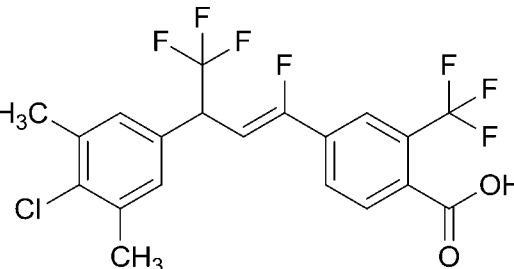
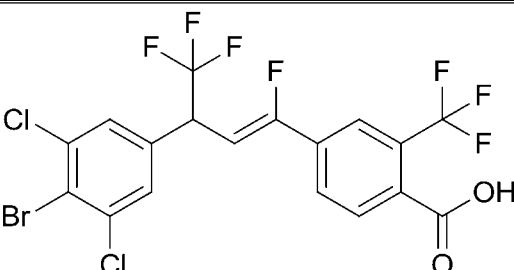
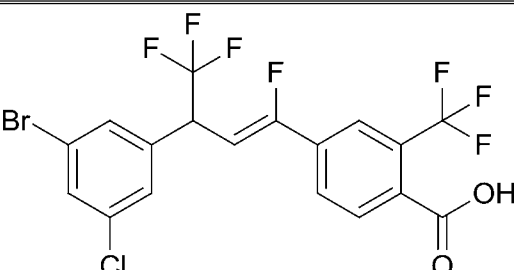
F21		13
F22		15
F23		15
F24		18
F25		15
F26		15

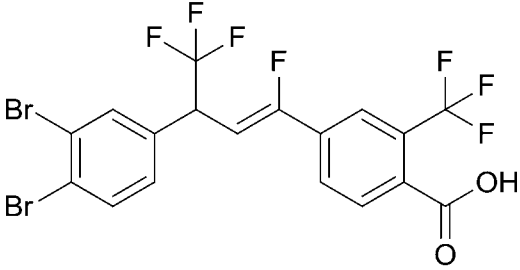
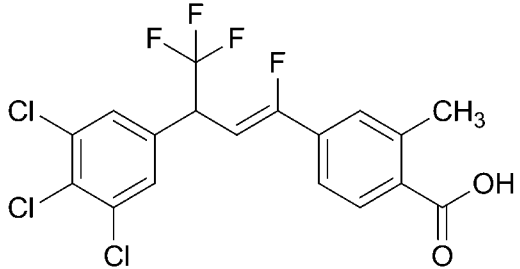
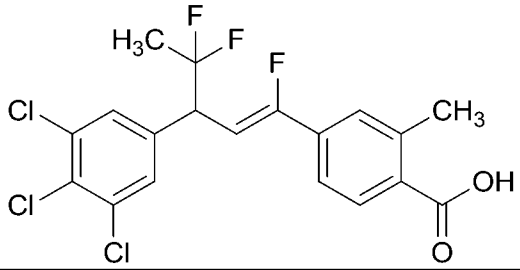
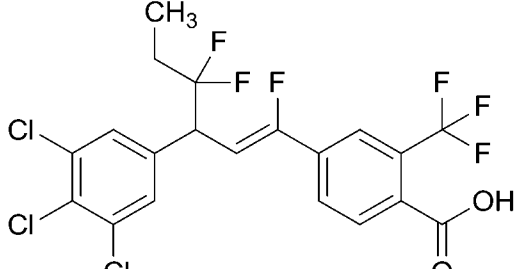
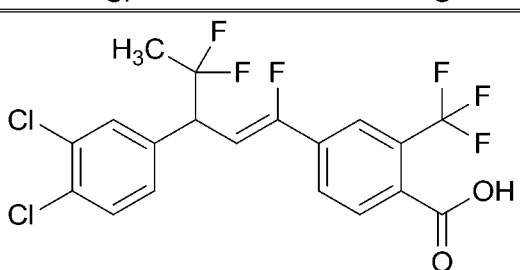
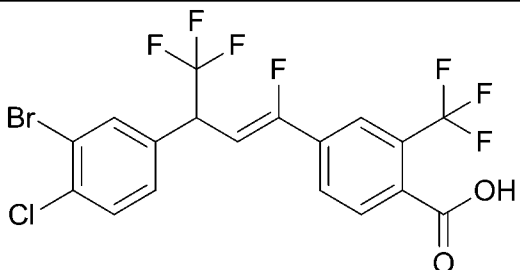
F27		14
F28		31
F29		16
F30		15

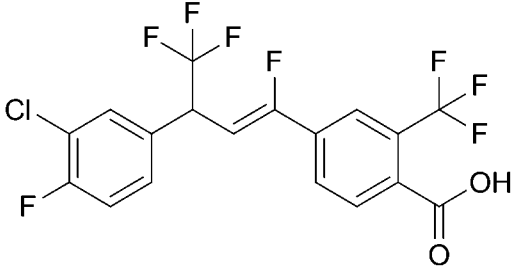
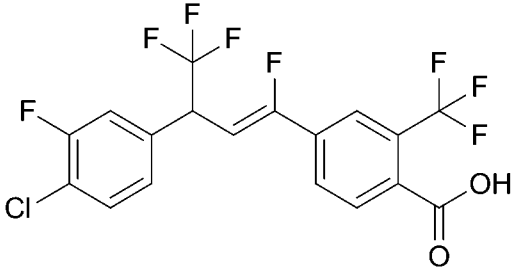
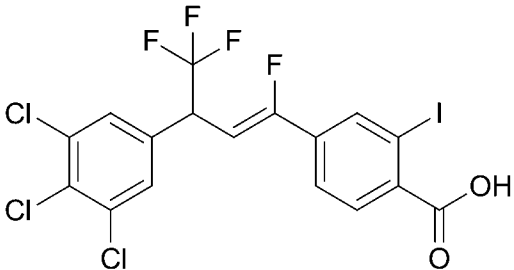
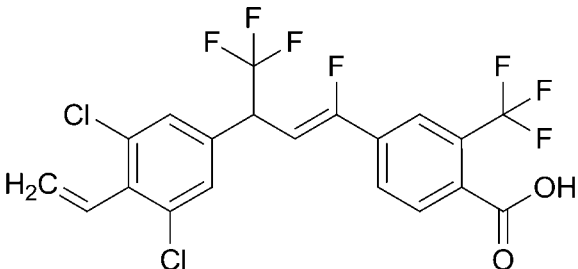
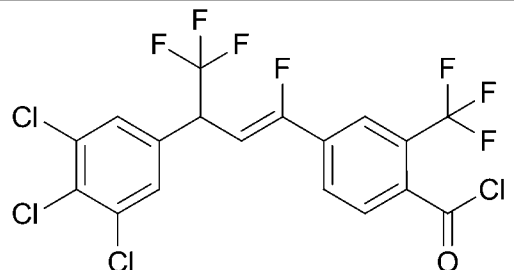
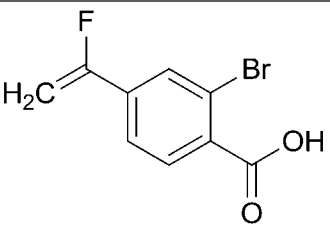
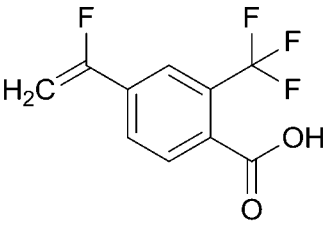
*依據實施例編號來製備

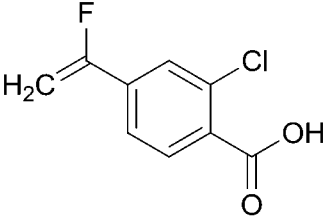
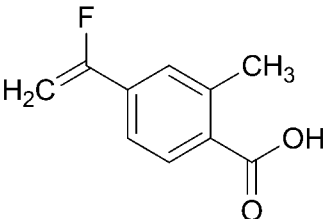
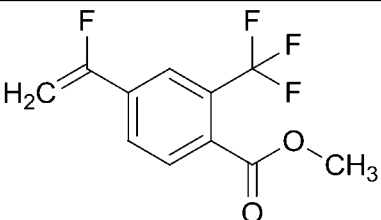
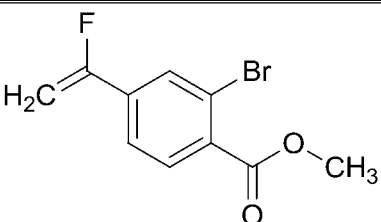
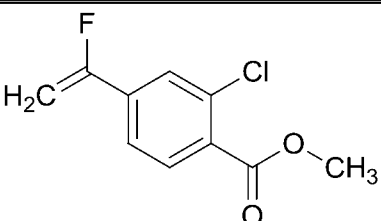
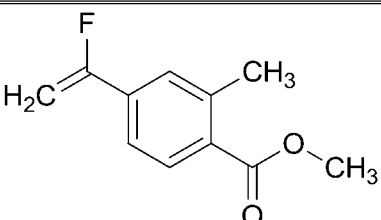
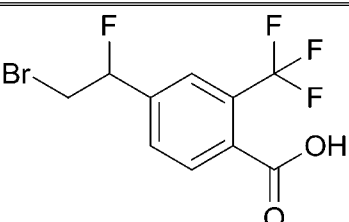
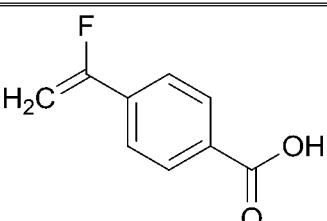
表3. C系列分子之結構和製備方法

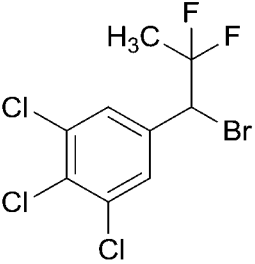
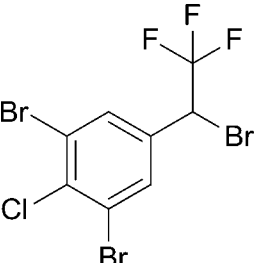
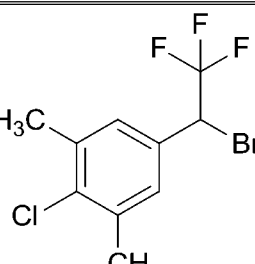
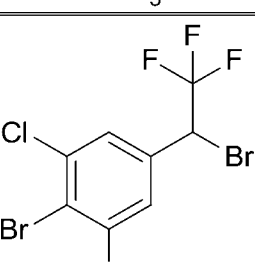
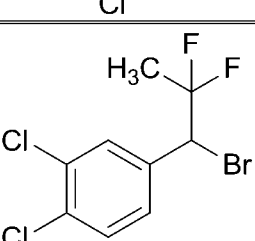
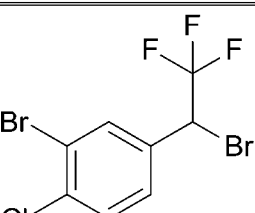
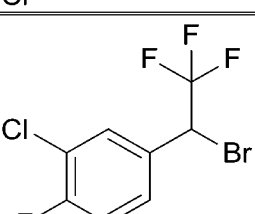
編號	結構	Prep. *
C1		1
C2		1
C3		1
C4		1
C5		1
C6		1

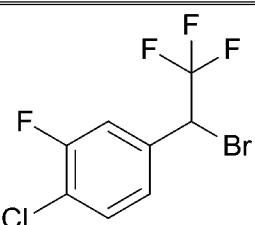
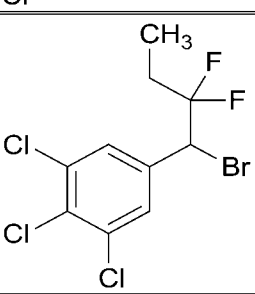
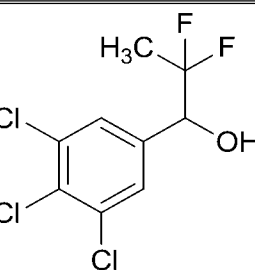
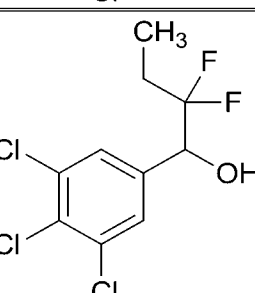
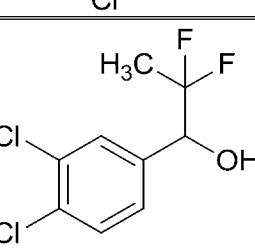
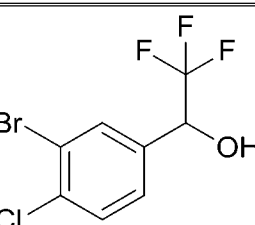
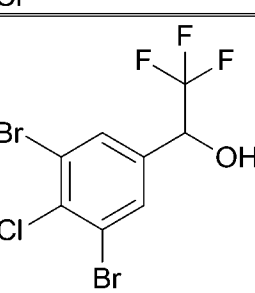
C7		1
C8		1
C9		1
C10		1
C11		1
C12		1

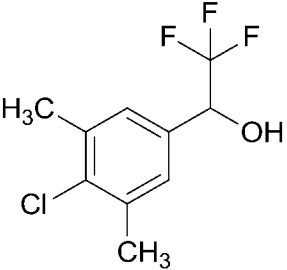
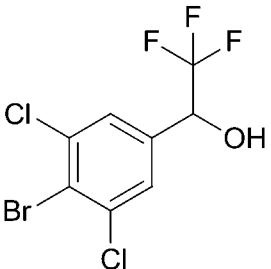
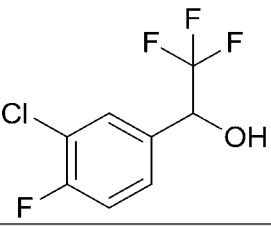
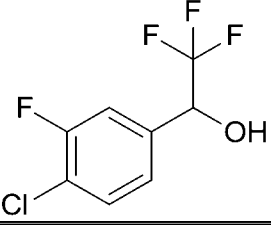
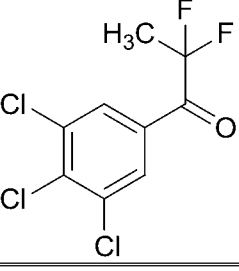
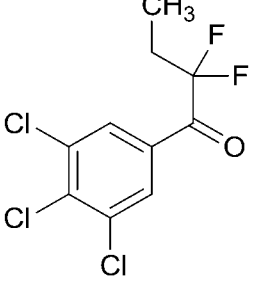
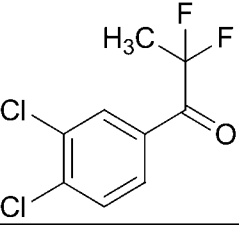
C13		1
C14		1
C15		1
C16		1
C17		1
C18		1

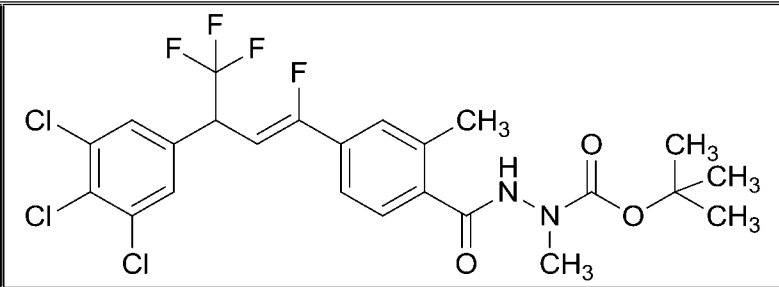
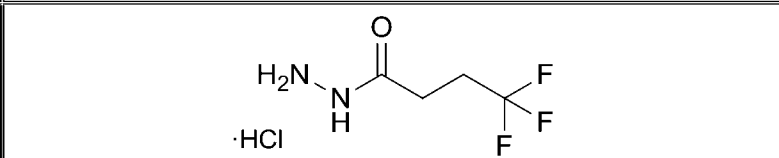
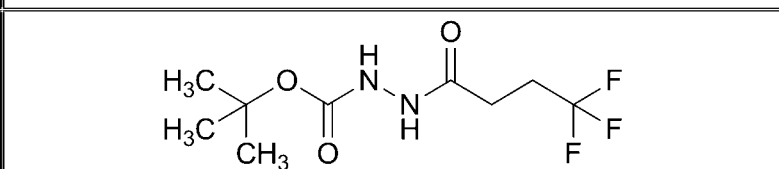
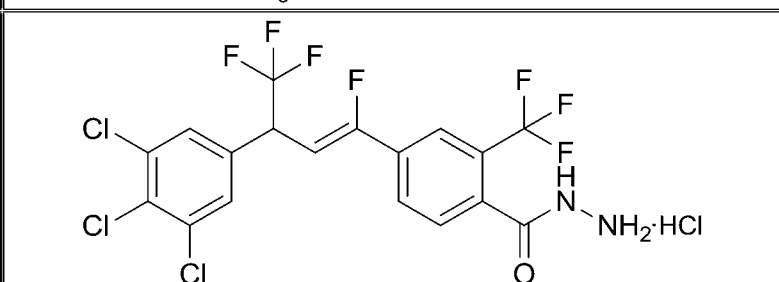
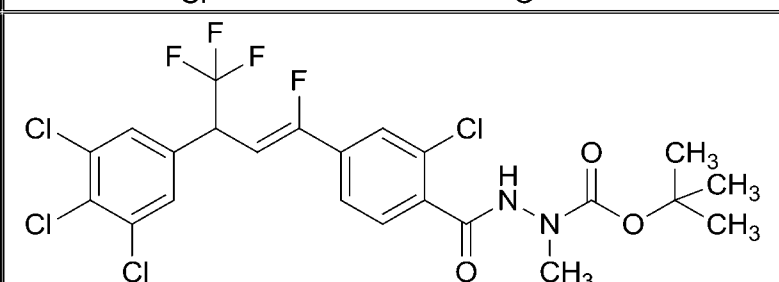
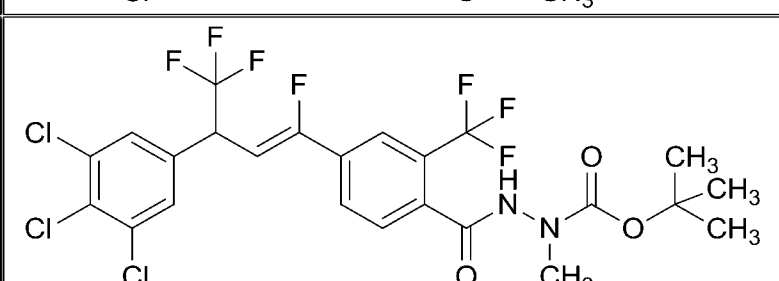
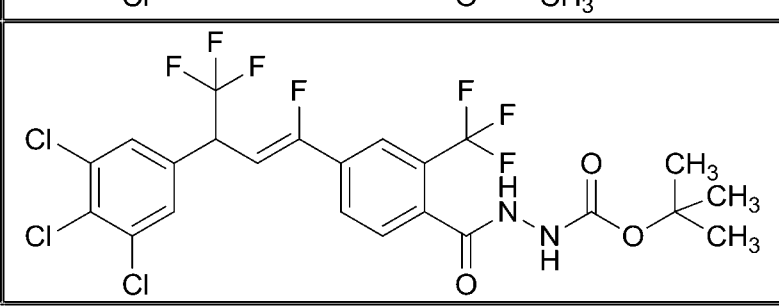
C19		1
C20		1
C21		2
C22		3
C23		4
C24		5
C25		5, 7

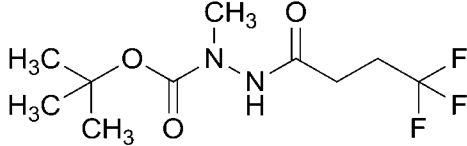
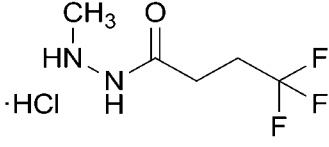
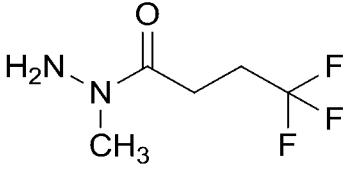
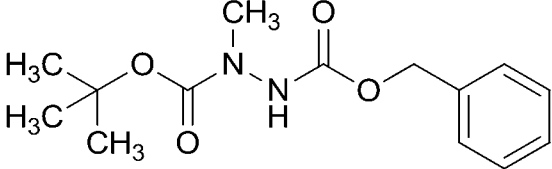
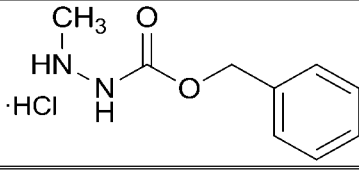
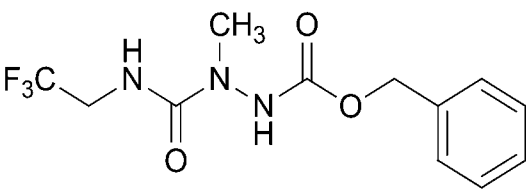
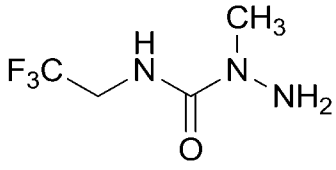
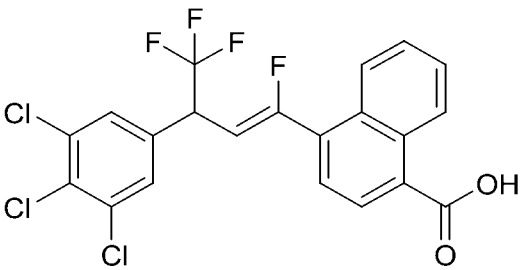
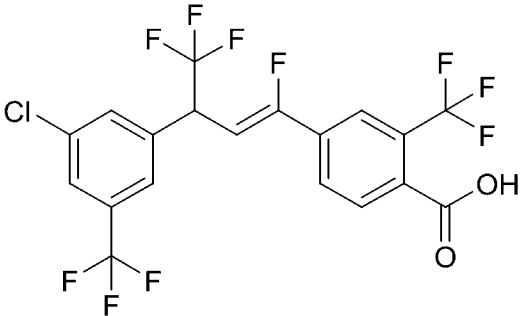
C26		5
C27		5, 7
C28		6
C29		6
C30		6
C31		6
C32		7
C33		7

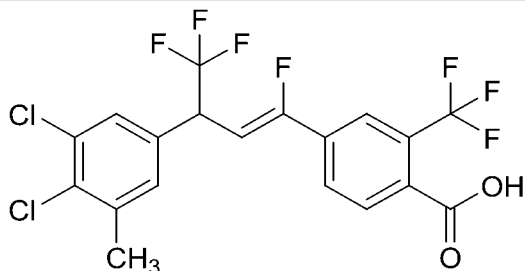
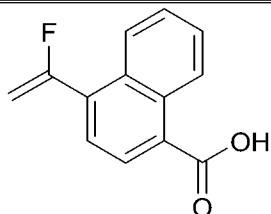
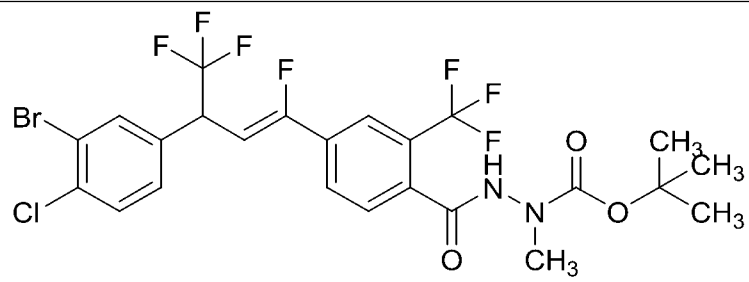
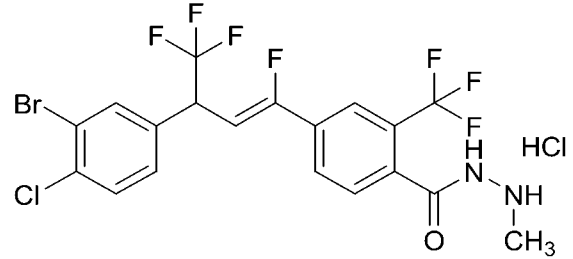
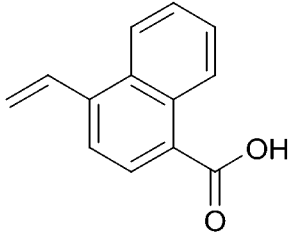
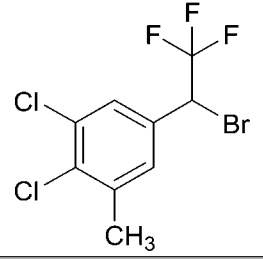
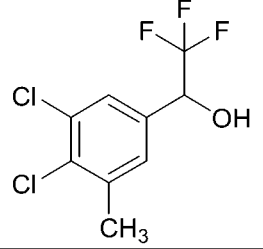
C34		8
C35		8
C36		8
C37		8
C38		8
C39		8
C40		8

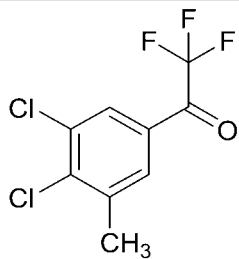
C41		8
C42		9
C43		10
C44		10
C45		10
C46		11
C47		11

C48	 <chem>CC1=CC=C(C=C1C(F)(F)F)Cl</chem>	11
C49	 <chem>ClC1=CC=C(C=C1C(F)(F)F)Br</chem>	11
C50	 <chem>Fc1ccc(cc1C(F)(F)F)Cl</chem>	11
C51	 <chem>Fc1ccc(cc1C(F)(F)F)Cl</chem>	11
C52	 <chem>CC(F)(F)C(=O)c1cc(Cl)c(Cl)cc1</chem>	12
C53	 <chem>CC(F)(F)C(=O)c1cc(Cl)c(Cl)cc1</chem>	12
C54	 <chem>CC(F)(F)C(=O)c1cc(Cl)c(Cl)cc1</chem>	12

C55		13
C56		19
C57		20
C58		21
C59		22
C60		22
C61		23

C 62		24
C 63		25
C 64		26
C 65		27
C 66		28
C 67		29
C 68		30
C 69		1
C 70		1

C71		1
C72		7
C73		13
C74		21
C75		32
C76		8
C77		10

C78		34
-----	---	----

* 依據實施例編號來製備

表 4：表 2 中分子之分析數據

編號	Mp (°C)	質量(<i>m/z</i>)	¹ H NMR	¹³ C NMR ; ¹⁹ F NMR ; IR
F1		648 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.58 (s, 1H), 7.89 (d, <i>J</i> = 1.6 Hz, 1H), 7.83 (dd, <i>J</i> = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.60 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 5.90 (dd, <i>J</i> = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 5.66 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.61 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 3.74 (qd, <i>J</i> = 9.0, 6.5 Hz, 2H), 3.14 (s, 3H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -58.74 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz), -69.28 (d, <i>J</i> = 2.2 Hz), -73.29 , -108.03 – -115.20 (m)
F2		644 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.77 (d, <i>J</i> = 1.7 Hz, 1H), 7.55 (dd, <i>J</i> = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 7.42 (s, 2H), 7.34 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 5.72 (dd, <i>J</i> = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.58 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 3.67 (t, <i>J</i> = 6.8 Hz, 2H), 3.17 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -69.40 , -69.40 , -110.84 – -112.94 (m)

F3		634 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 9.25 (d, <i>J</i> = 3.8 Hz, 1H), 8.59 (d, <i>J</i> = 4.0 Hz, 1H), 7.85 (s, 1H), 7.74 (dd, <i>J</i> = 8.1, 1.6 Hz, 1H), 7.63 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 6.26 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 5.84 (dd, <i>J</i> = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 4.60 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 3.79 - 3.60 (m, 2H)	¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ -59.22, -69.29 (d, <i>J</i> = 8.9 Hz), -73.32 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz), -112.16 (d, <i>J</i> = 15.7 Hz)
F4		633 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 10.00 (s, 1H), 9.68 (s, 1H), 7.92 - 7.76 (m, 1H), 7.73 (dd, <i>J</i> = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.59 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 5.83 (dd, <i>J</i> = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 4.59 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 2.55 (dd, <i>J</i> = 9.1, 6.4 Hz, 2H), 2.46 - 2.23 (m, 2H)	¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ -59.29, -60.65, -66.92, -111.90 (d, <i>J</i> = 32.7 Hz)
F5	122-125	719 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.51 (s, 1H), 10.26 (s, 1H), 8.18 - 8.08 (m, 4H), 7.69 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 6.88 (dd, <i>J</i> = 36.0, 10.4 Hz, 1H), 5.26 - 5.21 (m, 1H), 2.60 - 2.49 (m, 4H)	

F6		597 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.49 (s, 1H), 10.24 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.10 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 7.81 (s, 2H), 7.67 (s, 1H), 6.88 (dd, <i>J</i> = 35.6, 9.6 Hz, 1H), 5.23 - 5.18 (m, 1H), 2.60 - 2.47 (m, 4H)	IR(薄膜) 3209, 2925, 1610, 1120 cm ⁻¹
F7		597 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.51 (s, 1H), 10.26 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.10 (d, <i>J</i> = 9.6 Hz, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.75 - 7.67 (m, 3H), 6.88 (dd, <i>J</i> = 35.7, 9.9 Hz, 1H), 5.20 - 5.15 (m, 1H), 2.64 - 2.45 (m, 4H)	IR(薄膜) 3208, 2924, 1610, 1119 cm ⁻¹
F8		617 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.6 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 8.09 (s, 2H), 7.81 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 2H), 7.29 (br s, 1H), 7.69 (m, 1H), 6.86 (dd, <i>J</i> = 35.7, 9.9 Hz, 1H), 5.25 - 5.19 (m, 1H), 3.96 - 3.78 (m, 2H), 3.03 (s, 3H)	IR(薄膜) 3388, 2927, 1683, 1163 cm ⁻¹

F9	148-151	705 ([M+H ₂ O] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.50 (br s, 1H), 10.25 (br s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.10 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 7.97 (s, 2H), 7.91 (s, 1H), 7.69 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 6.85 (dd, <i>J</i> = 35.6, 10.2 Hz, 1H), 5.22 - 5.17 (m, 1H), 2.59 - 2.49 (m, 4H)	
F10	195-198	615 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.51 (br s, 1H), 10.27 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.09 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 8.01 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 7.70 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 6.86 (dd, <i>J</i> = 35.6, 10.2 Hz, 1H), 5.25 - 5.20 (m, 1H), 2.60 - 2.53 (m, 4H)	
F11		647 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.51 (s, 1H), 7.89 (d, <i>J</i> = 1.7 Hz, 1H), 7.88 - 7.78 (m, 1H), 7.56 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 6.02 - 5.79 (m, 1H), 4.77 - 4.48 (m, 1H), 3.20 (s, 3H), 2.69 - 2.56 (m, 2H), 2.43 (td, <i>J</i> = 10.3, 6.4 Hz, 2H)	¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ -58.78, -66.79, -69.29, -112.21

F12		633 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.53 (s, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.73 - 7.59 (m, 3H), 7.41 (s, 3H), 6.51 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 5.89 (dd, <i>J</i> = 33.7, 9.8 Hz, 1H), 4.26 (td, <i>J</i> = 14.2, 9.7 Hz, 1H), 3.75 (p, <i>J</i> = 8.6 Hz, 2H), 1.63 (t, <i>J</i> = 18.4 Hz, 3H)	¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ -59.19, -73.28, -93.14 - -96.86 (m), -114.93
F13		649 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 7.53 (m, 5H), 7.32 (s, 1H), 5.82 (ddd, <i>J</i> = 32.6, 15.6, 9.6 Hz, 1H), 4.60 (m, 1H), 3.32 (s, 2H), 3.08 (s, 1H), 2.33 (m, 4H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -60.40 (d, <i>J</i> = 63.4 Hz), -66.91 (d, <i>J</i> = 48.7 Hz), -69.33 (dd, <i>J</i> = 24.5, 2.3 Hz), -112.00 (d, <i>J</i> = 3.9 Hz) 旋轉異構體
F14		700 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.60 (br s, 1H), 8.18 (s, 1H), 8.09 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 7.96 (s, 2H), 7.91 - 7.90 (m, 1H), 7.30 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 1H), 6.89 (dd, <i>J</i> = 36.0, 10.0 Hz, 1H), 5.21 - 5.20 (m, 1H), 3.86 - 3.82 (m, 2H), 3.03 (s, 3H)	IR(薄膜) 3431, 2925, 1647, 1163 cm ⁻¹

F15		617 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.6 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.09 (s, 2H), 7.99 (br s, 1H), 7.75 - 7.65 (m, 2H), 7.30 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 6.89 (dd, <i>J</i> = 35.7, 9.9 Hz, 1H), 5.20 - 5.17 (m, 1H), 3.87 - 3.81 (m, 2H), 3.03 (s, 3H)	IR(薄膜) 3421, 2925, 1660, 1117 cm ⁻¹
F16		606 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.6 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.08 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 2H), 7.45 (s, 2H), 7.28 (br s, 1H), 6.83 (dd, <i>J</i> = 35.4, 9.9 Hz, 1H), 4.97 - 4.91 (m, 1H), 3.90 - 3.87 (m, 2H), 3.03 (s, 3H), 2.35 (s, 6H)	IR(薄膜) 3385, 2927, 1679, 1164 cm ⁻¹
F17		648 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.92 (s, 1H) 7.86 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 7.66 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.37 (s, 1H), 6.72 - 6.65 (dd, <i>J</i> = 18.0, 11.6 Hz, Hz, 1H), 5.94 - 5.74 (m, 3H), 4.63 - 4.58 (m, 1H), 3.94 - 3.88 (m, 2H), 3.30 (s, 3H)	IR(薄膜) 3393, 2920, 1667, 1267, 1163 cm ⁻¹

F18		734 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.62 (br s, 1H), 8.17 - 8.09 (m, 5H), 7.28 (s, 1H), 6.86 (dd, <i>J</i> = 36.0, 10.2 Hz, 1H), 5.23 - 5.19 (m, 1H), 4.10 - 3.84 (m, 2H), 3.03 (s, 3H)	IR(薄膜) 3431, 2924, 1674, 1165, 749 cm ⁻¹
F19		683 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.92 (d, <i>J</i> = 1.7 Hz, 1H), 7.87 - 7.74 (m, 2H), 7.62 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 5.87 (dd, <i>J</i> = 32.4, 9.6 Hz, 1H), 4.61 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 3.50 - 3.41 (m, 2H), 3.37 (d, <i>J</i> = 0.7 Hz, 3H), 2.80 (dq, <i>J</i> = 14.4, 9.9 Hz, 2H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -59.10, -66.08, -69.25, -69.26, -112.05.
F20			¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 10.48 (s, 1H), 10.19 (s, 1H), 7.62 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.55 (d, <i>J</i> = 1.7 Hz, 1H), 7.45 (dd, <i>J</i> = 8.3, 1.7 Hz, 1H), 7.42 (s, 2H), 5.78 (dd, <i>J</i> = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.57 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 2.72 - 2.56 (m, 2H), 2.51 - 2.32 (m, 2H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -66.95, -69.40 (d, <i>J</i> = 2.2 Hz), -112.33; IR(薄膜) 3197, 1674, 1136, 748 cm ⁻¹

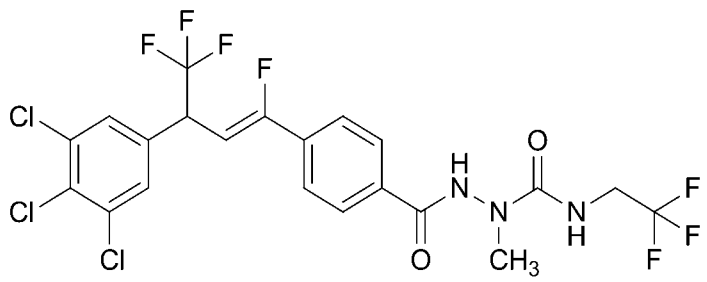
F 21			¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 10.19 (s, 1H), 9.98 (s, 1H), 7.96 (d, <i>J</i> = 1.6 Hz, 1H), 7.80 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 1H), 7.59 - 7.47 (m, 1H), 7.42 (q, <i>J</i> = 5.0, 4.2 Hz, 2H), 5.76 (ddd, <i>J</i> = 32.6, 17.2, 9.7 Hz, 1H), 4.57 (dt, <i>J</i> = 15.2, 8.9 Hz, 1H), 2.64 (td, <i>J</i> = 8.2, 7.6, 4.0 Hz, 2H), 2.43 (ddt, <i>J</i> = 20.9, 10.5, 7.8 Hz, 2H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -66.84 (d, <i>J</i> = 18.6 Hz), -69.38 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz), -112.18 (d, <i>J</i> = 83.9 Hz)
F 22		630 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.61 (br s, 1H), 8.17 (s, 1H), 8.09 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 2H), 8.00 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 7.30 (t, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 6.87 (dd, <i>J</i> = 35.6, 10.4 Hz, 1H), 5.26 - 5.25 (m, 1H), 3.86 - 3.82 (m, 2H), 3.03 (s, 3H)	IR(薄膜) 3436, 2926, 1663, 1119 cm ⁻¹
F 23		692 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.62 (br s, 1H), 8.17 (s, 1H), 8.09 (s, 2H), 8.00 (s, 2H), 7.28 (s, 1H), 6.86 (dd, <i>J</i> = 36.0, 10.2 Hz, 1H), 5.25 - 5.19 (m, 1H), 3.87 - 3.82 (m, 2H), 3.03 (s, 3H)	IR(薄膜) 3387, 2924, 1677, 1166, 749 cm ⁻¹

F24		669 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.10 (s, 1H), 7.93 (d, <i>J</i> = 1.8 Hz, 1H), 7.84 (dd, <i>J</i> = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.63 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 5.88 (dd, <i>J</i> = 32.4, 9.6 Hz, 1H), 4.61 (p, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H), 3.53 - 3.30 (m, 2H), 2.97 - 2.75 (m, 2H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -59.13, -66.07, -69.26, -112.17
F25		657 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.60 (br s, 1H), 8.18 (br s, 1H), 8.10 - 8.07 (m, 2H), 7.95 - 7.93 (m, 1H), 7.84 (br s, 1H), 7.80 - 7.79 (m, 1H), 7.28 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 1H), 6.89 (dd, <i>J</i> = 36.0, 10.4 Hz, 1H), 5.22 - 5.19 (m, 1H), 3.86 - 3.82 (m, 2H), 3.03 (s, 3H)	IR(薄膜) 3450, 1674, 1260, 750 cm ⁻¹
F26		701 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.60 (br s, 1H), 8.18 (s, 1H), 8.09 - 8.08 (m, 2H), 8.06 (s, 1H), 7.86 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.61 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 7.28 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 1H), 6.85 (dd, <i>J</i> = 36.0, 10.0 Hz, 1H), 5.20 - 5.21 (m, 1H), 3.89 - 3.80 (m, 2H), 3.00 (s, 3H)	IR(薄膜) 3430, 2925, 1673, 1163, 750 cm ⁻¹

F27	138-140	676 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.51 (br s, 1H), 10.26 (br s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.10 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 8.06 (s, 2H), 7.70 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.89 (dd, <i>J</i> = 35.7, 9.9 Hz, 1H), 5.27 - 5.21 (m, 1H), 2.58 - 2.48 (m, 4H)	
F28		594 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.81 (s, 1H), 7.52 - 7.38 (m, 5H), 5.76 (dd, <i>J</i> = 32.7, 9.6 Hz, 1H), 5.48 (t, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 4.59 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 3.95 - 3.77 (m, 2H), 3.27 (s, 3H), 2.51 (s, 3H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -69.40 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz), -73.14, -108.40 - -113.11 (m)
F29		593.1 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.50 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 7.90 (d, <i>J</i> = 1.5 Hz, 1H), 7.86 - 7.78 (m, 1H), 7.73 (d, <i>J</i> = 8.2 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 5.85 (dd, <i>J</i> = 32.4, 9.6 Hz, 1H), 4.61 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 1.26 (s, 9H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -59.28, -69.29 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz), -112.01 (d, <i>J</i> = 2.6 Hz); IR(薄膜) 3228, 2969, 1629 cm ⁻¹

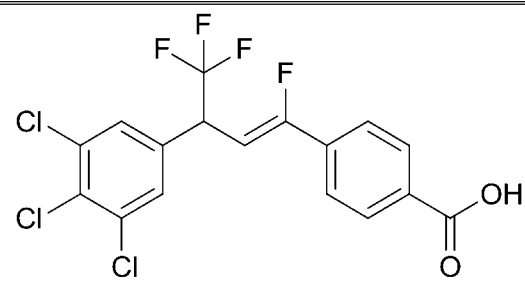
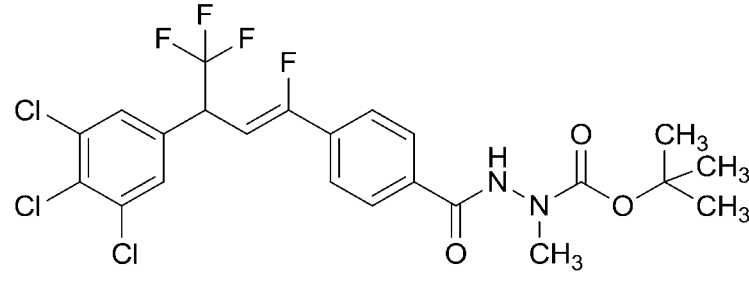
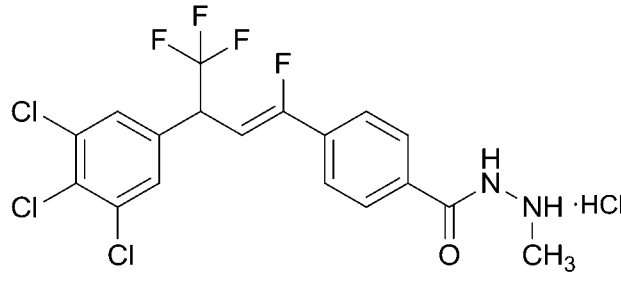
F30		629.20 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.32 (s, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.10 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.78 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.45 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 1H), 6.55 (dd, <i>J</i> = 8.7, 14.7 Hz, 1H), 5.13 - 5.07 (m, 1H), 4.02 - 3.92 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 1.98 (s, 3H)	IR(薄膜) 3402, 2928, 1659, 827 cm ⁻¹
-----	--	---------------------------------	--	---

表5. FC系列化合物之結構和製備方法

編號	結構	Prep.*
FC1		31

* 依據實施例編號來製備

表6：CC系列分子之結構和製備方法

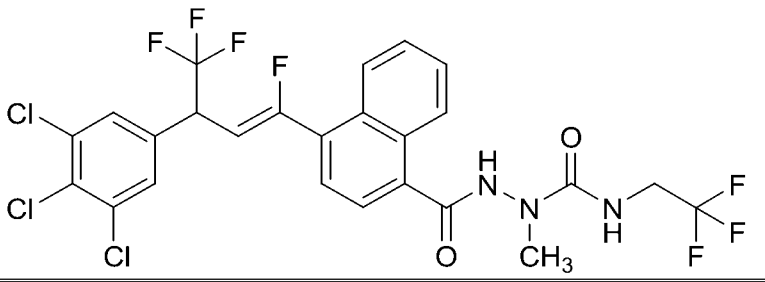
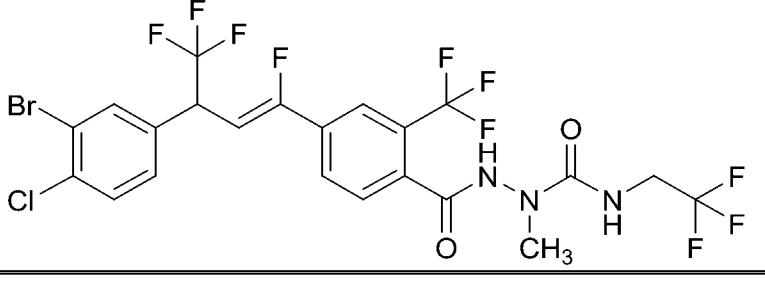
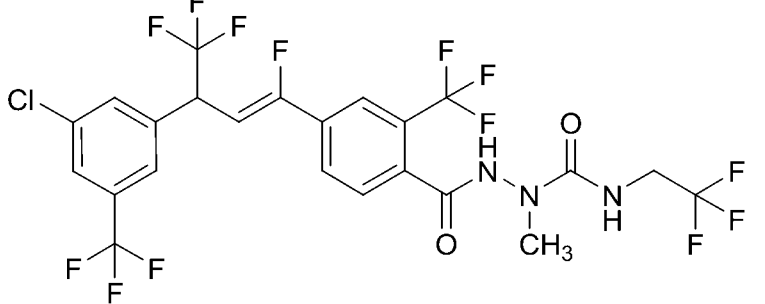
編號	結構	Prep. *
CC1		1
CC2		13
CC3		31

*依據實施例編號來製備

表7：表5中化合物之分析數據

編號	Mp (°C)	質量 (m/z)	¹ H NMR	¹³ C NMR ; ¹⁹ F NMR ; IR
FC1		580 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.96 (s, 1H), 7.93 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 7.73 - 7.60 (m, 2H), 7.44 (s, 2H), 5.84 (dd, <i>J</i> = 32.7, 9.6 Hz, 1H), 5.73 (t, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 4.60 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 3.95 - 3.75 (m, 2H), 3.23 (s, 3H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -69.39 (d, <i>J</i> = 2.2 Hz), -73.09 , -110.57 – -115.65 (m)

表8. pF系列分子之結構和製備方法

編號	結構	Prep. *
PF1		15
PF8		33
PF9		14

*依據實施例編號來製備

表9：表8中分子之分析數據

編號	Mp (°C)	質量 (<i>m/z</i>)	¹ H NMR	¹³ C NMR ; ¹⁹ F NMR ; IR
PF1		628.30 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.64 (br s, 1H), 8.33 - 8.31 (m, 1H), 8.08 (s, 2H), 7.99 - 7.97 (m, 1H), 7.94 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 7.78 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H), 7.72 - 7.57 (m, 2H), 7.50 - 7.47 (m, 1H), 6.32 (dd, <i>J</i> = 10.4, 34.4 Hz, 1H), 5.35 - 5.31 (m, 1H), 3.87 - 3.83 (m, 2H), 3.16 (s, 3H)	IR(薄膜) 3392, 2924, 1683, 765 cm ⁻¹
PF8		658.16 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 7.91 (s, 1H), 7.86 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 1H), 7.66 - 7.63 (m, 2H), 7.54 (br s, 1H), 7.50 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 7.31 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 5.96 (dd, <i>J</i> = 9.3, 32.4 Hz, 1H), 5.46 (s, 1H), 4.66 - 4.60 (m, 1H), 3.94 - 3.89 (m, 2H), 3.29 (s, 3H)	IR(薄膜) 3413, 2928, 1674, 750 cm ⁻¹
PF9		648.00 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.62 (s, 1H), 8.18 - 8.07 (m, 5H), 7.95 (s, 1H), 7.30 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H), 6.98 (dd, <i>J</i> = 10.2, 35.7 Hz, 1H), 5.41 - 5.35 (m, 1H), 3.87 - 3.82 (m, 2H), 3.03 (s, 3H)	

BAW、CEW & CL 分級表	
控制(或死亡率) %	分級
50-100	A
大於 0 – 小於 50	B
未測試	C
在此生物分析中未觀察到活性	D

GPA & YFM 分級表	
控制(或死亡率) %	分級
80-100	A
大於 0 – 小於 80	B
未測試	C
在此生物分析中未觀察到活性	D

表ABC：生物結果

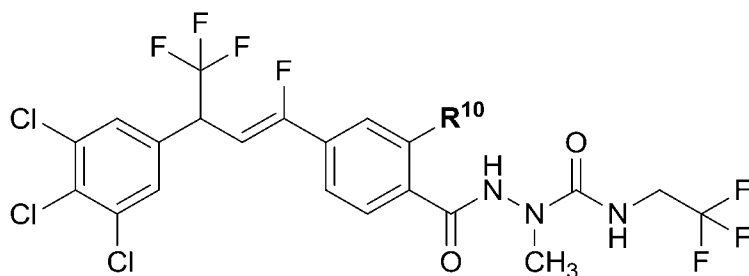
編號	害蟲			
	BAW	CL	GPA	YFM
F1	A	A	C	C
F2	A	A	C	C
F3	A	A	C	C
F4	A	A	C	C
F5	A	A	C	A
F6	A	A	C	A

F7	A	A	C	A
F8	A	A	C	A
F9	A	A	C	A
F10	A	A	C	A
F11	A	A	C	C
F12	A	A	C	C
F13	A	A	C	C
F14	A	A	C	A
F15	A	A	C	A
F16	A	A	C	A
F17	A	A	C	C
F18	A	A	C	C
F19	A	A	C	C
F20	A	A	C	C
F21	A	A	C	C
F22	A	A	C	A
F23	A	A	C	C
F24	A	A	C	C
F25	A	A	C	A
F26	B	B	C	A
F27	A	A	C	A
F29	A	A	C	C
F30	A	A	C	D
PF1	A	A	C	C
PF8	A	A	B	A
PF9	A	A	C	C

比較數據

【0288】對BAW及CL進行之生物分析係按照實施例A：對甜菜夜蛾(**Beet Armyworm**) (“**BAW**”)與甘藍銀紋夜蛾(**Cabbage Looper**) (“**CL**”)之生物分析中概述之流程、使用所示的濃度來進行。結果在表CD1中示出。

表CD1

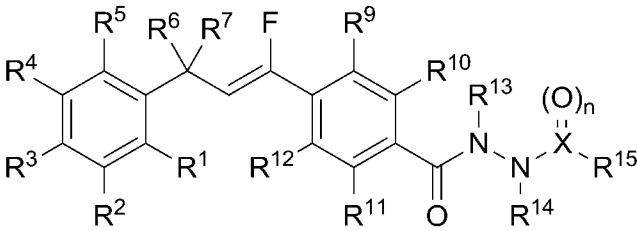


編號	R ¹⁰	5 μg/cm ²		0.5 μg/cm ²		0.05 μg/cm ²	
		BAW	CL	BAW	CL	BAW	CL
FC1	H	25*	7	0	0	0	0
F28	CH ₃	100	100	100	100	88	100
F1	CF ₃	100	100	100	100	100	100

*控制(或死亡率)百分比

【發明申請專利範圍】

【第1項】 一種具下式之分子



式1

其中：

(A) **R¹**、**R⁵**、**R⁶**、**R¹¹**及**R¹²**各自獨立地選自於下列所構成的群組：H、F、Cl、Br、I、CN、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基，以及(C₁-C₄)鹵烷氧基；

(B) **R²**、**R³**及**R⁴**各自獨立地選自於下列所構成的群組：H、F、Cl、Br、I、CN、(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基，以及(C₁-C₄)鹵烷氧基；

(C) **R⁷**為(C₁-C₆)鹵烷基；

(D) **R⁹**係選自於下列所構成的群組：**(F)**、H、F、Cl、Br、I、CN、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基，以及(C₁-C₄)鹵烷氧基；

(E) **R¹⁰**係選自於下列所構成的群組：**(F)**、F、Cl、Br、I、CN、(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基，以及(C₁-C₄)鹵烷氧基；

(F) **R⁹**及**R¹⁰**能選擇性地一起形成一個3至5員飽和或不飽和的烴基(hydrocarbyl)鍵聯，

其中該烴基鍵聯可選擇性地以一個或更多個獨立地選自於下列所構成的群組之取代基予以取代：F、Cl、Br、I及CN；

(G) R^{13} 及 R^{14} 各自獨立地選自於下列所構成的群組：H、(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基，以及(C₁-C₄)鹵烷氧基；

(H) X係選自於下列所構成的群組：C、S及P(C₁-C₆)烷基；

(I) n為1或2；

(J) R^{15} 係選自於下列所構成的群組：(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷氧基、苯基及NH(C₁-C₄)鹵烷基，

其中各個烷基、烯基、鹵烷基、烷氧基、鹵烷氧基及苯基可以選擇性地以一個或更多個獨立地選自於下列所構成的群組之取代基予以取代：F、Cl、Br、I、CN及OH；以及

該式1分子之農業上可接受的酸加成鹽類、鹽類衍生物、溶劑合物、酯類衍生物、結晶性多形體、同位素、解析的立體異構物，以及互變異構物。

【第2項】 如請求項1之分子，其中

(A) R^1 、 R^5 、 R^6 、 R^{11} 及 R^{12} 為H；

(B) R^2 、 R^3 及 R^4 各自獨立地選自於下列所構成的群組：H、F、Cl、Br、I、(C₁-C₄)烷基、(C₂-C₄)烯基以及(C₁-C₄)鹵烷基；

(C) R^7 為 (C_1-C_6) 鹵烷基；

(D) R^9 為 H；

(E) R^{10} 係選自於下列所構成的群組：H、F、Cl、Br、I、 (C_1-C_4) 烷基以及 (C_1-C_4) 鹵烷基；

(G) R^{13} 及 R^{14} 各自獨立地選自於下列所構成的群組：H 及 (C_1-C_4) 烷基；

(H) X 係選自於下列所構成的群組：C 及 S；

(I) n 為 1 或 2；以及

(J) R^{15} 係選自於下列所構成的群組： (C_1-C_4) 鹵烷基及 $NH(C_1-C_4)$ 鹵烷基。

【第3項】 如請求項1之分子，其中該分子係選自於表2的該等分子中之一者。

【第4項】 如請求項1之分子，其中該分子係選自於表1的該等分子中之一者。

【第5項】 一種殺蟲組成物，其包含一如請求項1、2、3及4中任一項之分子，其進一步包含一或更多種活性成分。

【第6項】 如請求項5之殺蟲組成物，其中該活性成分係來自活性成分群組 α (AIGA)。

【第7項】 如請求項5之殺蟲組成物，其中該活性成分係選自於下列所構成的群組：**AI-1**、1,3-二氯丙烯、陶斯松(chlorpyrifos)、甲基陶斯松(chlorpyrifos-methyl)、六伏隆(hexaflumuron)、滅芬諾(methoxyfenozide)、多氟脲(noviflumuron)、賜諾特(spinetoram)、賜諾殺

(spinosad)、氟啉蟲胺腈(sulfoxaflor)，以及磺醯氟。

【第8項】 一種殺蟲組成物，其包含一如請求項1、2、3及4中任一項之分子，其進一步包含一**MoA**材料。

【第9項】 如請求項7之殺蟲組成物，其中該**MoA**材料係來自**MoA**材料群組 α (**MoAMGA**)。

【第10項】 如請求項5、6、7、8及9中任一項之殺蟲組成物，其中該如式1之分子與該活性成分之重量比係選自於表B。

【第11項】 一種控制一害蟲的方法，該方法包含施用一殺蟲有效量的如請求項1、2、3及4中任一項之分子至一所在地。

【第12項】 一種控制一害蟲的方法，該方法包含施用一殺蟲有效量的如請求項5、6、7、8、9及10中任一項之殺蟲組成物至一所在地。

【第13項】 如請求項12之方法，其中該害蟲為螞蟥、蚜蟲、甲蟲、蠹蟲(bristletails)、蟑螂、蟋蟀、螻蛄(earwigs)、跳蚤、蒼蠅、蚱蜢、葉蟬、蝨(包括海蝨)、蝗蟲、蠕、蛾、線蟲(nematode)、介殼蟲、綜合綱(symphylans)、白蟻、薊馬(thrips)、壁蝨、胡蜂，及/或粉虱。

【第14項】 一種方法，其包含施用如請求項1、2、3及4中任一項之分子，或如請求項5、6、7、8、9及10中任一項之殺蟲組成物，至一種子。

【第15項】 一種方法，其包含施用如請求項1、2、3

及4中任一項之分子至一包括一非人類動物之所在地，以控制內寄生蟲及/或外寄生蟲。