



(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 201726662 A

(43)公開日：中華民國 106 (2017) 年 08 月 01 日

(21)申請案號：105131306

(22)申請日：中華民國 105 (2016) 年 09 月 29 日

(51)Int. Cl.：

C07D403/14 (2006.01)

C07D409/14 (2006.01)

C07D417/14 (2006.01)

A01N43/56 (2006.01)

A01N43/78 (2006.01)

(30)優先權：2015/10/02

歐洲專利局

15188188.5

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

瑞士

(72)發明人：埃爾 魁克米 麥利姆 EL QACEMI, MYRIEM (FR)；比格特 奧倫李恩 BIGOT, AURELIEN (FR)；愛德門斯 安德魯 EDMUNDS, ANDREW (GB)；卡格內培恩 朱利安 丹尼爾 亨利 GAGNEPAIN, JULIEN DANIEL HENRI (FR)；珍關納特 安卓 JEANGUENAT, ANDRE (CH)；披特爾納 湯瑪士 PITTERNA, THOMAS (AT)；史托勒 安卓 STOLLER, ANDRE (CH)；賽貝汀 大衛 SABBADIN, DAVIDE (IT)

(74)代理人：閻啟泰；林景郁

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：13 項 圖式數：0 共 177 頁

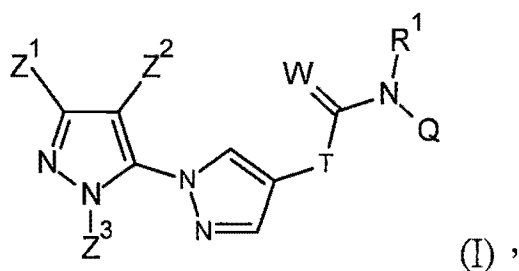
(54)名稱

殺有害生物活性吡唑衍生物

PESTICIDALLY ACTIVE PYRAZOLE DERIVATIVES

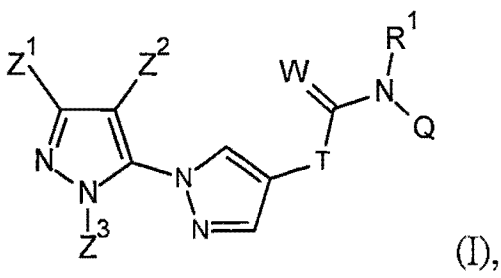
(57)摘要

本發明涉及具有式(I)之化合物



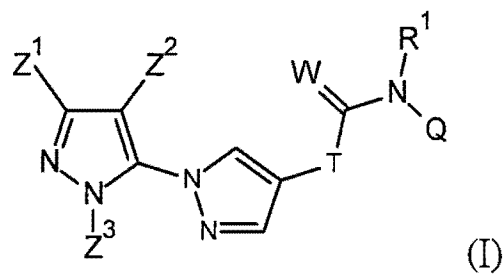
如在此定義的，涉及用於製備它們的方法，涉及包含它們的殺有害生物組成物，特別是殺昆蟲的、殺蟎的、殺軟體動物的以及殺線蟲的組成物，並且涉及使用它們來對抗和控制有害生物例如昆蟲、蟎、軟體動物以及線蟲有害生物之方法。

The invention relates to compounds of formula (I)



as defined herein, to processes for preparing them, to pesticidal, in particular insecticidal, acaricidal, molluscicidal and nematocidal compositions comprising them and to methods of using them to combat and control pests such as insect, acarine, mollusc and nematode pests.

特徵化學式：



發明摘要

※ 申請案號： 105131306

※ 申請日： 105/09/29

※IPC 分類： **C07D 403/14** (2006.01)

C07D 409/14 (2006.01)

C07D 417/14 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

A01N 43/78 (2006.01)

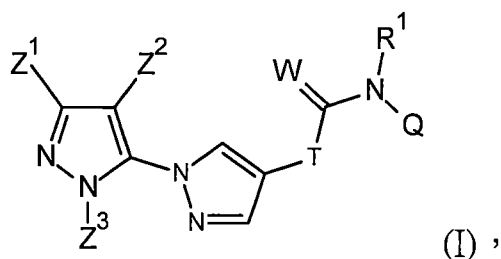
【發明名稱】(中文/英文)

殺有害生物活性吡唑衍生物

Pesticidally active pyrazole derivatives

【中文】

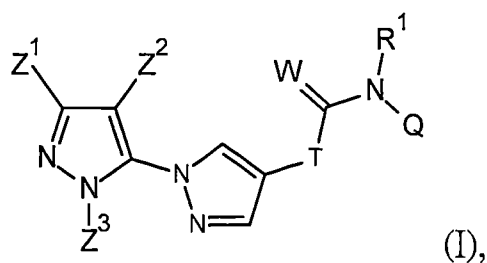
本發明涉及具有式 (I) 之化合物



如在此定義的，涉及用於製備它們的方法，涉及包含它們的殺有害生物組成物，特別是殺昆蟲的、殺蟎的、殺軟體動物的以及殺線蟲的組成物，並且涉及使用它們來對抗和控制有害生物例如昆蟲、蟎、軟體動物以及線蟲有害生物之方法。

【英文】

The invention relates to compounds of formula (I)



as defined herein, to processes for preparing them, to pesticidal, in particular insecticidal, acaricidal, molluscicidal and nematocidal compositions comprising them and to methods of using them to combat and control pests such as insect, acarine, mollusc and nematode pests.

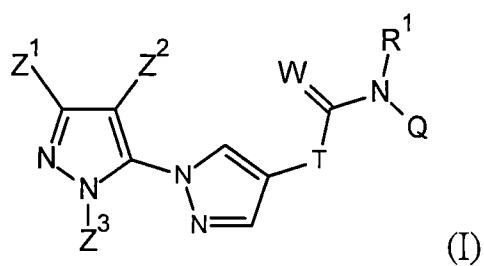
【代表圖】

【本案指定代表圖】：無。

【本代表圖之符號簡單說明】：

無

【本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式】：



發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動)

【發明名稱】(中文/英文)

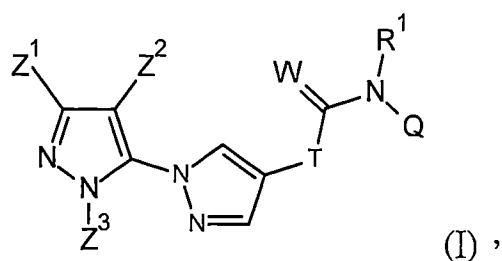
殺有害生物活性吡唑衍生物

Pesticidally active pyrazole derivatives

【0001】 本發明涉及吡唑衍生物，涉及用於製備它們的方法，涉及用於製備它們的中間體，涉及包括那些衍生物的殺有害生物組成物，尤其是殺昆蟲的、殺蟎的、殺軟體動物的以及殺線蟲的組成物，並且涉及使用它們來防治與控制有害生物例如昆蟲、蟎、軟體動物以及線蟲有害生物之方法。

【0002】 現在已經出人意料地發現某些吡唑衍生物具有高度有效的殺昆蟲特性。在該範圍內的其他化合物係從 WO 2014/122083、WO 2012/107434、WO 2015/067646、WO 2015/067647、WO 2015/067648、WO 2015/150442、WO 2015/193218 和 WO 2010/051926 已知的。

【0003】 因此，作為實施方式 1，本發明涉及具有式 (I) 之化合物，



其中

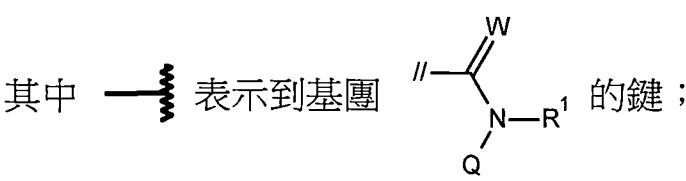
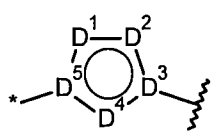
R¹ 選自 H、C₁-C₆-烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₃-C₇環烷

基-C₁-C₃-烷基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基、芳基(C₀-C₃)-烷基和雜芳基(C₀-C₃)-烷基，其中每個 C₁-C₆-烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₃-C₇環烷基-C₁-C₃-烷基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基、芳基(C₀-C₃)-烷基和雜芳基(C₀-C₃)-烷基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、氰基、C₁-C₆-烷氧基和 C₁-C₆-烷氧基羰基的取代基取代的；

Q 選自 H、羥基、-C(=O)H、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₃-C₇雜環烷基、C₃-C₇環烷基-C₁-C₃-烷基、C₁-C₃-烷基-C₃-C₇環烷基、芳基(C₀-C₃)-烷基、雜芳基(C₀-C₃)-烷基、*N*-C₁-C₆-烷基胺基、*N*-C₁-C₆-烷基羰基胺基和 *N,N*-二(C₁-C₆-烷基)胺基，其中每個 C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₃-C₇雜環烷基、C₃-C₇環烷基-C₁-C₃-烷基、C₁-C₃-烷基-C₃-C₇環烷基、芳基(C₀-C₃)-烷基、雜芳基(C₀-C₃)-烷基、*N*-C₁-C₆-烷基胺基、*N*-C₁-C₆-烷基羰基胺基和 *N,N*-二(C₁-C₆-烷基)胺基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、羥基、硝基、胺基、氰基、C₁-C₆-鹵烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷氧基羰基、-C(=O)OH、C₁-C₆-烷基胺基甲醯基、-C(=O)NH₂、-C(=S)NH₂、C₃-C₆-環烷基胺基甲醯基和苯基的取代基取代的；

W 係 O 或 S；

T 係具有下式的 5 員雜芳基



並且*表示到該吡唑環的鍵；

D^1 係選自 CR^{6a} 、N、 NR^{6b} 、O 和 S；

D^2 係選自 CR^{7a} 、N、 NR^{7b} 、O 和 S；

D^3 係 C 或 N；

D^4 係選自 CR^{8a} 、N、 NR^{8b} 、O 和 S；

D^5 係 C 或 N；

其條件係 D^1 、 D^2 、 D^3 、 D^4 和 D^5 中的至少一個係選自 N、O 和 S， D^1 、 D^2 和 D^4 中的不多於一個係 O 或 S，並且 D^1 、 D^2 、 D^3 、 D^4 和 D^5 中的不多於三個係 N；

R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} 獨立地選自 H、鹵素、氰基、硝基、胺基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -烷基氫硫基、 C_1 - C_6 -烷基亞磺醯基和 C_1 - C_6 -烷基磺醯基，其中每個 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -烷基氫硫基、 C_1 - C_6 -烷基亞磺醯基和 C_1 - C_6 -烷基磺醯基係未取代的或被 1 至 7 個鹵素取代的；

R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 獨立地選自 H 和 C_1 - C_6 -烷基，其中 C_1 - C_6 -烷基係未取代的或被 1 至 7 個鹵素取代的；

Z^1 選自 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_3 - C_7 雜環烷基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_3 - C_6 -環烷基，其中每個 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_3 - C_7 雜環烷基、 C_1 - C_6 -烷基和 C_3 - C_6 -環烷基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、羥基、硝基、胺基、氰基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基、 $-C(=O)OH$ 、 C_1 - C_6 -烷基胺基甲醯基、 C_3 - C_6 -環烷基胺基甲醯基和苯基的取代基取代的；

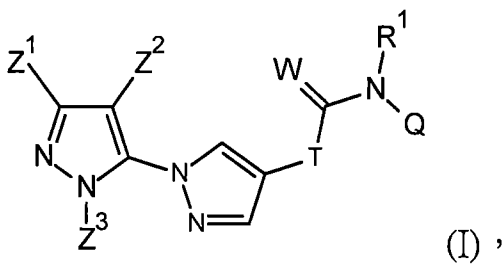
Z^2 選自 H、鹵素、氰基、硝基、胺基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_3 - C_7 -雜環烷基、

C₃-C₇環烷基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-烷基氫硫基、C₁-C₆-烷基亞磺醯基和 C₁-C₆-烷基磺醯基，其中每個 C₁-C₆-烷氧基、C₃-C₇-雜環烷基、C₃-C₇環烷基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-烷基氫硫基、C₁-C₆-烷基亞磺醯基和 C₁-C₆-烷基磺醯基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、羥基、硝基、胺基、氰基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-鹵烷氧基、C₁-C₆-烷氧基羰基、-C(=O)OH、C₁-C₆-烷基胺基甲醯基、C₃-C₆-環烷基胺基甲醯基和苯基的取代基取代的；

Z³ 選自 H、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-環烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、芳基和雜芳基，其中每個 C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-環烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、芳基和雜芳基，係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、羥基、硝基、胺基、氰基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷氧基羰基、-C(=O)OH、C₁-C₆-烷基胺基甲醯基、C₃-C₆-環烷基胺基甲醯基和苯基的取代基取代的；

或其農用化學上可接受的鹽或 N-氧化物。

實施方式 1.1：本發明涉及具有式 (I) 之化合物，



其中

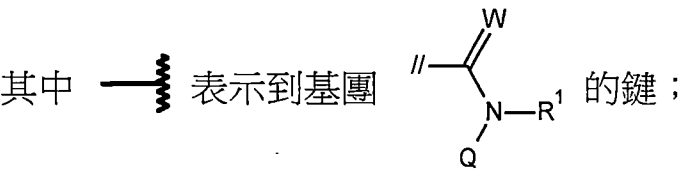
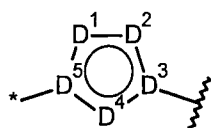
R¹ 選自 H、C₁-C₆-烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₃-C₇環烷基-C₁-C₃-烷基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基、芳基(C₀-C₃)-烷基和雜芳基(C₀-C₃)-烷基，其中每個 C₁-C₆-烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₃-C₇環烷基-C₁-C₃-烷基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基、芳基(C₀-C₃)-烷基和雜

芳基(C₀-C₃)-烷基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、氰基、C₁-C₆-烷氧基和 C₁-C₆-烷氧基羰基的取代基取代的；

Q 選自 H、羥基、-C(=O)H、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₃-C₇雜環烷基、C₃-C₇環烷基-C₁-C₃-烷基、C₁-C₃-烷基-C₃-C₇環烷基、芳基(C₀-C₃)-烷基、雜芳基(C₀-C₃)-烷基、*N*-C₁-C₆-烷基胺基、*N*-C₁-C₆-烷基羰基胺基和 *N,N*-二(C₁-C₆-烷基)胺基，其中每個 C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₃-C₇雜環烷基、C₃-C₇環烷基-C₁-C₃-烷基、C₁-C₃-烷基-C₃-C₇環烷基、芳基(C₀-C₃)-烷基、雜芳基(C₀-C₃)-烷基、*N*-C₁-C₆-烷基胺基、*N*-C₁-C₆-烷基羰基胺基和 *N,N*-二(C₁-C₆-烷基)胺基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、羥基、硝基、胺基、氰基、C₁-C₆-鹵烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷氧基羰基、-C(=O)OH、C₁-C₆-烷基胺基甲醯基、-C(=O)NH₂、-C(=S)NH₂、C₃-C₆-環烷基胺基甲醯基和苯基的取代基取代的；

W 係 O 或 S；

T 係具有下式的 5 員雜芳基



並且*表示到該吡唑環的鍵；

D¹ 係選自 CR^{6a}、N、NR^{6b}、O 和 S；

D² 係選自 CR^{7a}、N、NR^{7b}、O 和 S；

D^3 係 C 或 N；

D^4 係選自 CR^{8a} 、N、 NR^{8b} 、O 和 S；

D^5 係 C 或 N；

其條件係 D^1 、 D^2 、 D^3 、 D^4 和 D^5 中的至少一個係選自 N、O 和 S， D^1 、 D^2 和 D^4 中的不多於一個係 O 或 S， D^1 、 D^2 、 D^3 、 D^4 和 D^5 中的不多於四個係 N，並且 D^3 和 D^5 不同時是 N；

R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} 獨立地選自 H、鹵素、氰基、硝基、胺基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -烷基氫硫基、 C_1 - C_6 -烷基亞磺醯基和 C_1 - C_6 -烷基磺醯基，其中每個 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -烷基氫硫基、 C_1 - C_6 -烷基亞磺醯基和 C_1 - C_6 -烷基磺醯基係未取代的或被 1 至 7 個鹵素取代的；

R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 獨立地選自 H 和 C_1 - C_6 -烷基，其中 C_1 - C_6 -烷基係未取代的或被 1 至 7 個鹵素取代的；

Z^1 選自 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷氧基、 C_3 - C_7 雜環烷基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_3 - C_6 -環烷基，其中每個 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷氧基、 C_3 - C_7 雜環烷基、 C_1 - C_6 -烷基和 C_3 - C_6 -環烷基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、羥基、硝基、胺基、氰基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基、 $-C(=O)OH$ 、 C_1 - C_6 -烷基胺基甲醯基、 C_3 - C_6 -環烷基胺基甲醯基和苯基的取代基取代的；

Z^2 選自 H、鹵素、氰基、硝基、胺基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_3 - C_7 -雜環烷基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -烷基氫硫基、 C_1 - C_6 -烷基亞磺醯基和 C_1 - C_6 -烷基磺醯基，其中每個 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_3 - C_7 -雜環烷基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -烷基氫硫基、 C_1 - C_6 -烷基亞磺醯基和

C₁-C₆-烷基磺醯基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、羥基、硝基、胺基、氰基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷氧基羰基、-C(=O)OH、C₁-C₆-烷基胺基甲醯基、C₃-C₆-環烷基胺基甲醯基和苯基的取代基取代的；

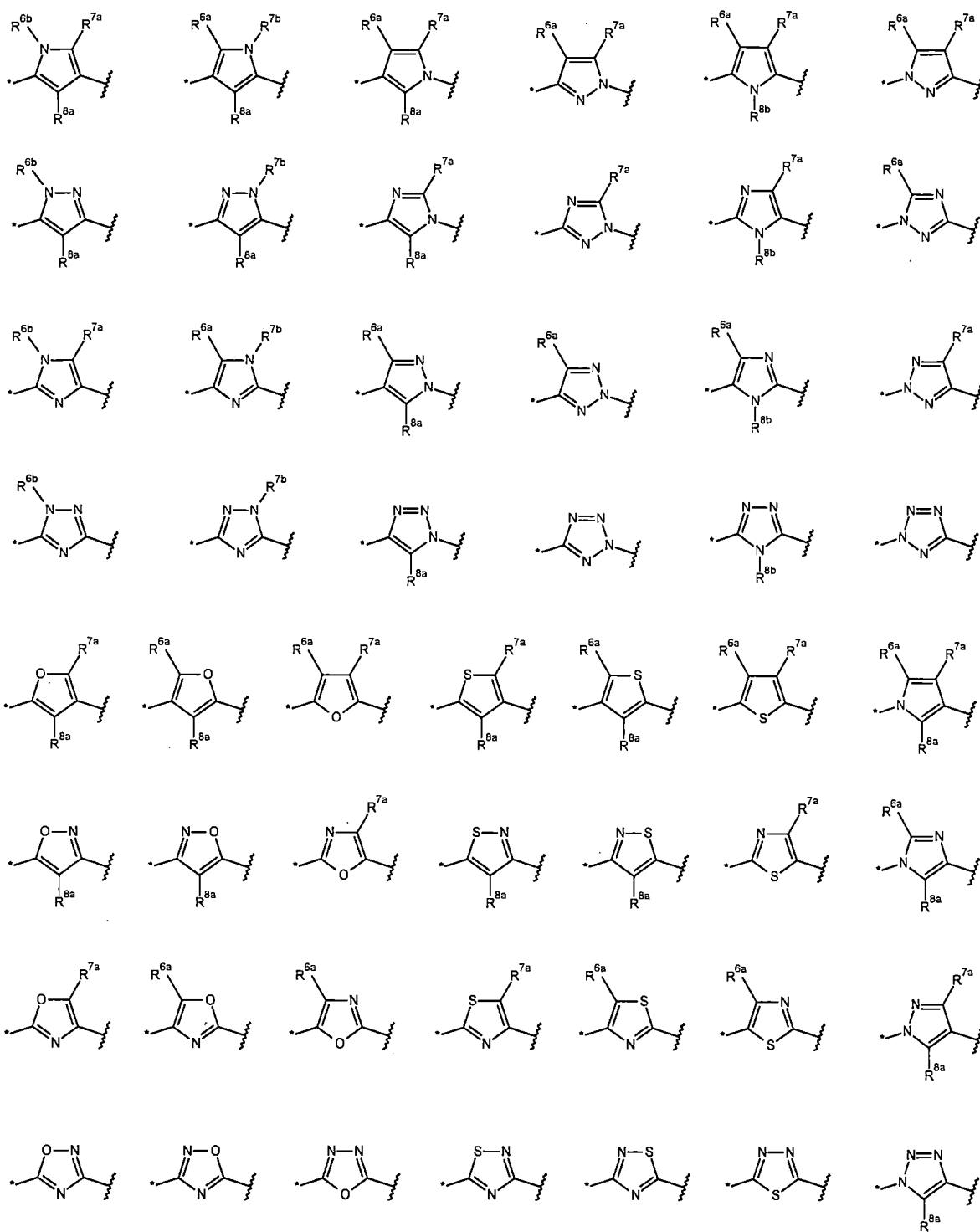
Z³ 選自 H、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-環烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、芳基和雜芳基，其中每個 C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-環烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、芳基和雜芳基，係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、羥基、硝基、胺基、氰基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷氧基羰基、-C(=O)OH、C₁-C₆-烷基胺基甲醯基、C₃-C₆-環烷基胺基甲醯基和苯基的取代基取代的；

或其農用化學上可接受的鹽或 N-氧化物。

【0004】 D¹、D²、D³、D⁴、D⁵、R¹、W、R^{6a}、R^{6b}、R^{7a}、R^{7b}、R^{8a}、R^{8b}、Q、Z¹、Z²和 Z³關於本發明的每種化合物（包括中間化合物）的較佳的值係如在以下實施方式 2 至 68 中列出的。

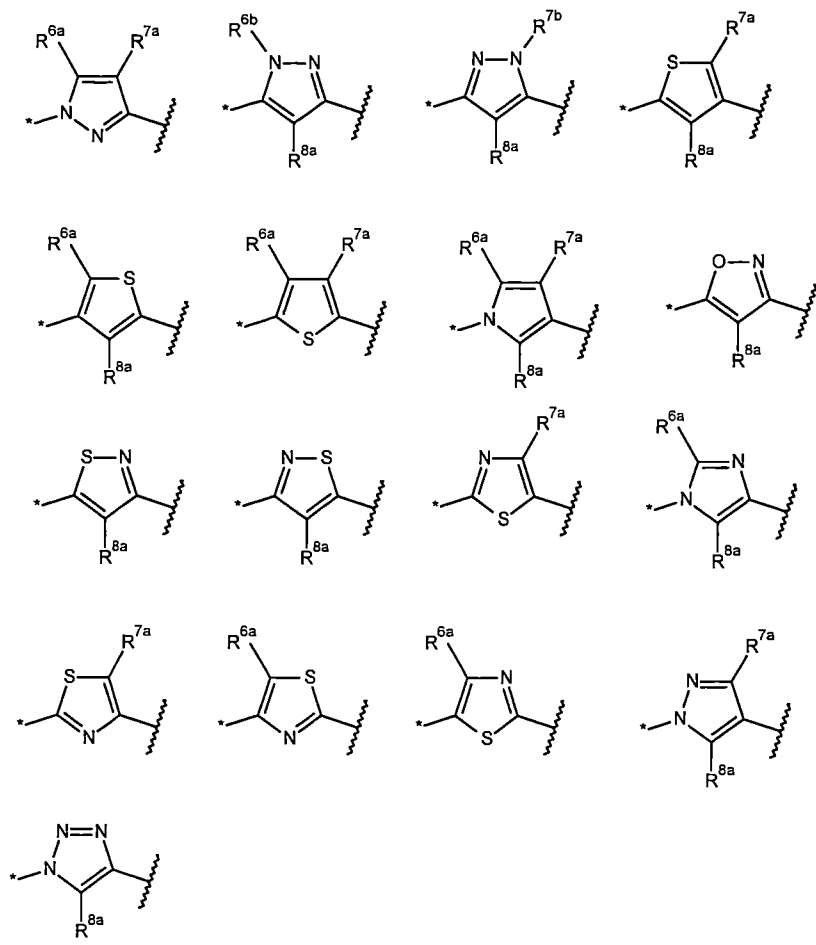
【0005】 如在此所用，當一個實施方式藉由使用術語“根據……中任一項”（例如“根據實施方式 1 至 5 中任一項”）指的是若干其他實施方式時，所述實施方式不僅指的是由整數如 1 和 2 指示的實施方式，而且還指的是由具有小數部分的數字如 1.1、1.2 或 2.1、2.2、2.3 指示的實施方式。

實施方式 2：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係選自



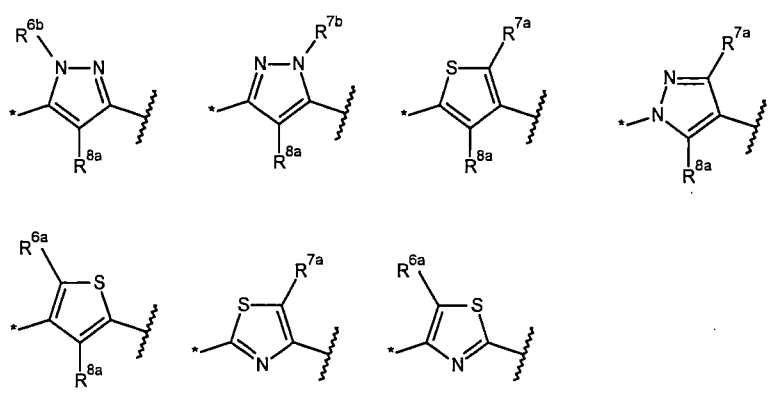
其中*表示到該吡唑基團的鍵。

實施方式 2.1：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係選自



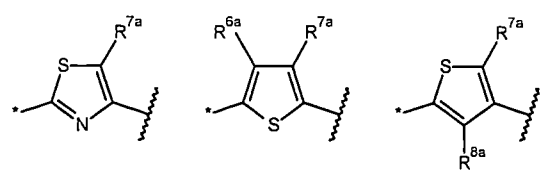
其中*表示到該吡啶基團的鍵。

實施方式 2.2：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係選自



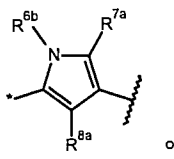
其中*表示到該吡啶基團的鍵。

實施方式 3：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係選自

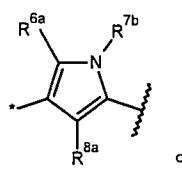


其中*表示到該吡唑基團的鍵。

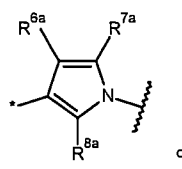
實施方式 4：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



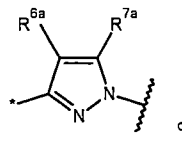
實施方式 5：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



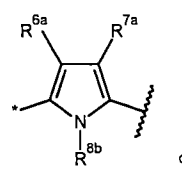
實施方式 6：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



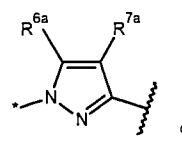
實施方式 7：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



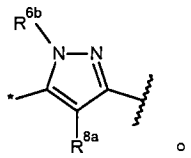
實施方式 8：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



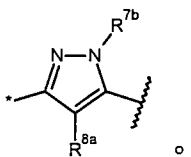
實施方式 9：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



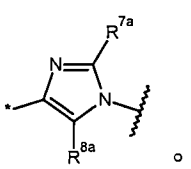
實施方式 10：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



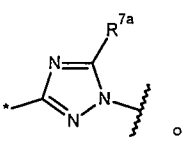
實施方式 11：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



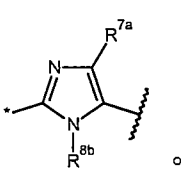
實施方式 12：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



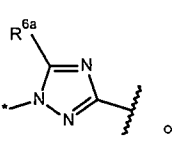
實施方式 13：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



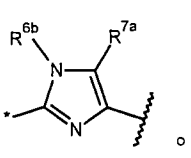
實施方式 14：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



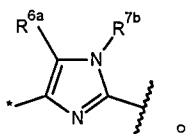
實施方式 15：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



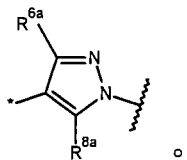
實施方式 16：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



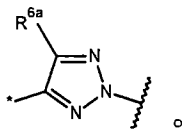
實施方式 17：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



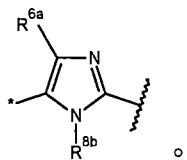
實施方式 18：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



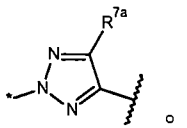
實施方式 19：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



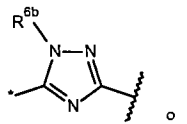
實施方式 20：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



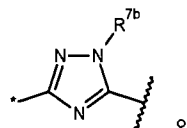
實施方式 21：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



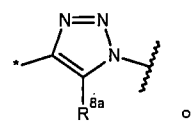
實施方式 22：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



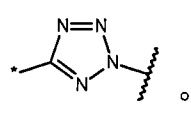
實施方式 23：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



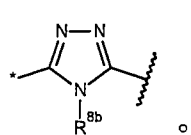
實施方式 24：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



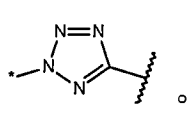
實施方式 25：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



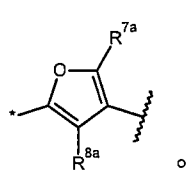
實施方式 26：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



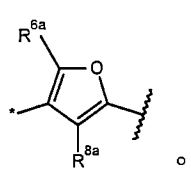
實施方式 27：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



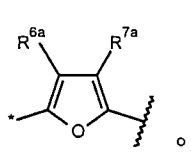
實施方式 28：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



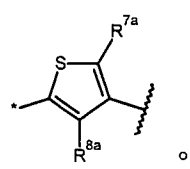
實施方式 29：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



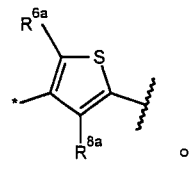
實施方式 30：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



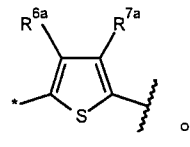
實施方式 31：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



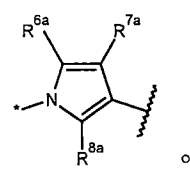
實施方式 32：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



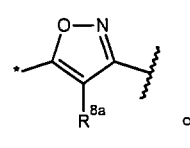
實施方式 33：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



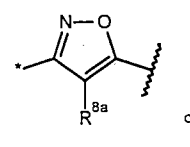
實施方式 34：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



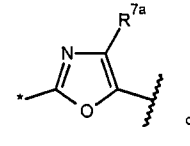
實施方式 35：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



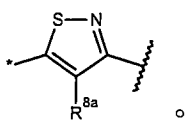
實施方式 36：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



實施方式 37：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



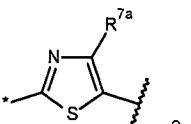
實施方式 38：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



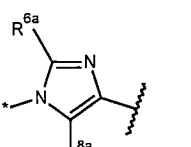
實施方式 39：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



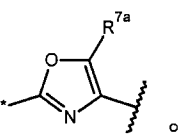
實施方式 40：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



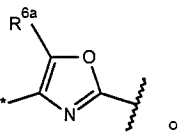
實施方式 41：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



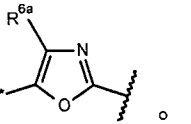
實施方式 42：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



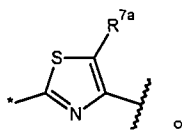
實施方式 43：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



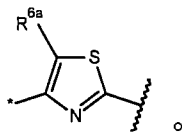
實施方式 44：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



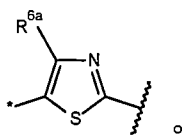
實施方式 45：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



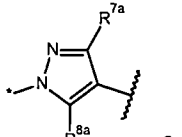
實施方式 46：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



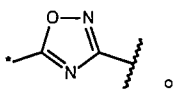
實施方式 47：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



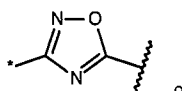
實施方式 48：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



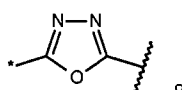
實施方式 49：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



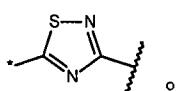
實施方式 50：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



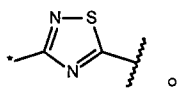
實施方式 51：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



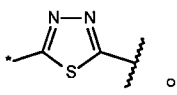
實施方式 52：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



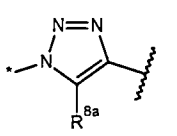
實施方式 53：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



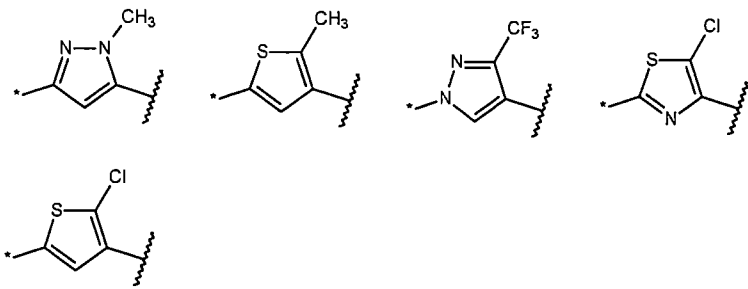
實施方式 54：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



實施方式 55：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



實施方式 55.1：根據實施方式 1 所述之化合物或鹽，其中 T 係



其中*表示到該吡唑基團的鍵。

實施方式 56：根據實施方式 1 至 55 中任一項所述之化合物或鹽，其中

R¹ 係選自 H、甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、二級

丁基、三級丁基、丙烯基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、丙氧基甲基、甲基

羰基、乙基羰基、正丙基羰基、異丙基羰基、二級丁基羰基、三級丁基羰

基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正丙氧基羰基、異丙氧基羰基、二級丁氧

基羰基、三級丁氧基羰基、氰甲基、2-氰乙基、苄基、4-甲氧基苄基、吡啶

-2-基-甲基、吡啶-3-基-甲基、吡啶-4-基-甲基和 4-氯-吡啶-3-基-甲基。

實施方式 56.1：根據實施方式 1 至 55 中任一項所述之化合物或鹽，其

中

R¹ 係選自 H、C₁-C₆-烷基、C₂-C₆烯基、C₁-C₆-鹵烷基和 C₂-C₆-鹵烯基。

實施方式 57：根據實施方式 1 至 55 中任一項所述之化合物或鹽，其中

R¹ 係選自 H、甲基、乙基、烯丙基以及正丙基。

實施方式 58：根據實施方式 1 至 55 中任一項所述之化合物或鹽，其中

R¹ 係 H、乙基或甲基。

實施方式 59：根據實施方式 1 至 58 中任一項所述之化合物或鹽，其中

Q 選自 H、羥基、-C(=O)H、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₃-C₇雜環烷基、C₃-C₇環烷基-C₁-C₃-烷基、C₁-C₃-烷基-C₃-C₇環烷基、芳基(C₀-C₃)-烷基、雜芳基(C₀-C₃)-烷基、*N*-C₁-C₆-烷基胺基、*N*-C₁-C₆-烷基羰基胺基和 *N,N*-二(C₁-C₆-烷基)胺基，其中每個 C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₃-C₇雜環烷基、C₃-C₇環烷基-C₁-C₃-烷基、C₁-C₃-烷基-C₃-C₇環烷基、芳基(C₀-C₃)-烷基、雜芳基(C₀-C₃)-烷基、*N*-C₁-C₆-烷基胺基、*N*-C₁-C₆-烷基羰基胺基和 *N,N*-二(C₁-C₆-烷基)胺基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、羥基、硝基、胺基、氰基、C₁-C₆-鹵烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷氧基羰基、-C(=O)OH、C₁-C₆-烷基胺基甲醯基、-C(=O)NH₂、-C(=S)NH₂、C₃-C₆-環烷基胺基甲醯基和苯基的取代基取代的。

實施方式 59.1：根據實施方式 1 至 58 中任一項所述之化合物或鹽，其

中 Q 係選自 H、C₁-C₆-烷基、C₃-C₇環烷基、C₃-C₇環烷基-C₁-C₃-烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、苄基，其中每個 C₁-C₆-烷基、C₃-C₇環烷基、C₃-C₇環烷基-C₁-C₃-烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、苄基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自氰基、-C(=O)-NH₂、-C(=S)-NH₂、硝基、-NH₂、鹵素和 C₁-C₆-鹵烷基的取代基取代的。

實施方式 59.2：根據實施方式 1 至 58 中任一項所述之化合物或鹽，其中 Q 係選自 C₁-C₆-烷基和 C₃-C₇環烷基，其中該 C₁-C₆-烷基或 C₃-C₇環烷基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自氰基、-C(=O)-NH₂、-C(=S)-NH₂和鹵素的取代基取代的。

實施方式 59.3：根據實施方式 1 至 58 中任一項所述之化合物或鹽，其中 Q 係選自 C₃-C₇環烷基，其係未取代的或被 1 至 3 個氰基取代基取代的。

實施方式 60：根據實施方式 1 至 58 中任一項所述之化合物或鹽，其中 Q 係選自 H、甲基、乙基、正丙基、1-甲基乙基、1,1-二甲基乙基、1-甲基丙基、異丙基、異丁基、1-(三氟甲基)環丙基、正丁基、2-甲基丙基、2-甲基丁基、羥乙基、2-羥丙基、氰甲基、2-氰乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1-三氟甲基乙基、2,2-二氟丙基、3,3,3-三氟丙基、2,2-二甲基-3-氟丙基、環丙基、2-氟-環丙基、2-(三氟甲基)環丙基、1-氰基-環丙基、1-羥羰基-環丙基、1-甲氧基羰基-環丙基、1-(N-甲基胺基甲醯基)環丙基、1-胺基甲醯基-環丙基、1-胺基硫代甲醯基-環丙基、1-(N-環丙基胺基甲醯基)環丙基、環丙基-甲基、環丁基、環戊基、環己基、1-環丙基乙基、雙(環丙基)甲基、2,2-二甲基環丙基-甲基、2-苯基環丙基、2,2-二氯環丙基、反式-2-氯環丙基、順式-2-氯環丙基、2,2-二氟環丙基、反式-2-氟環丙基、順式-2-氟環丙基、反式-4-羥基環己基、4-三氟甲基環己基、丙-2-烯基、2-甲基丙-2-烯基、2-氟烯丙基、3,3-二氯烯丙基、2-氯烯丙基、丙-2-炔基、1,1-二甲基丁-2-炔基、3-氯-丙-2-烯基、3-氟-丙-2-烯基、3,3-二氯-丙-2-烯基、3,3-二氯-1,1-二甲基丙-2-烯基、氧雜環丁-3-基、噻呔-3-基、1-氧(oxido)-噻呔-3-基、1,1-二氧-噻呔-3-基、異噁唑-3-基甲基、1,2,4-三唑-3-基甲基、3-甲基氧雜環丁-3-

基甲基、苄基、2,6-二氟苯基甲基、3-氟苯基甲基、2-氟苯基甲基、2,5-二氟
苯基甲基、1-苯基乙基、4-氯苯基乙基、2-三氟甲基苯基乙基、1-吡啶-2-基
乙基、吡啶-2-基甲基、5-氟吡啶-2-基甲基、(6-氯-吡啶-3-基)甲基、嘧啶-2-
基甲基、甲氧基、2-乙氧基乙基、2-甲氧基乙基、2-(甲基氫硫基)乙基、1-
甲基-2-(乙基氫硫基)乙基、2-甲基-1-(甲基氫硫基)丙烷-2-基、甲氧基羰基、
甲氧基羰基甲基、NH₂、N-乙基胺基、N-烯丙基胺基、N,N-二甲基胺基、N,N-
二乙基胺基、2-噻吩基甲基、異丙基、異丁基、甲基磺醯基、甲基亞磺醯基、
3-(甲基氫硫基)-環丁基、2-側氧基-2[(2,2,2)-三氟乙基)胺基]乙基、1-(CF₃)環丙
基、2-甲基環丙基、1,1,1-三氟丙烷-2-基、丁-2,3-二烯-1-基、3-氯丙-2-烯-1-
基、3-氟基噻唑-3-基、3-(甲基磺醯基)環丁基、4-氟苯基、2-[(甲基亞磺醯基)
甲基]環丁基、3-甲基丁-2-基、2-(甲基磺醯基)環丁基、2-(二甲基胺基)乙基
和 2-甲氧基乙基；或

Q 係選自苯基、萘基、嗒吡、吡吡、嘧啶、三吡、吡啶、吡啶、噻唑、
異噻唑、噁唑、異噁唑、三唑、咪唑、呋喃、噻吩、吡咯、噁二唑、噻二
唑、四唑和四氫呋喃，它們各自是未取代的或被 1 至 4 個獨立地選自 V 的
取代基取代的；

V 係選自氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、甲基、乙基、二氟甲基、羥
基、三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、
2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,2,2,2-四氟乙基、1-氯-1,2,2,2-四氟乙基、2,2,2-
三氯乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、1,1-二氟乙基、五氟乙基七氟-正丙基、七氟-
異丙基、九氟-正丁基、環丙基、環丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、1-
甲基乙氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、氯-二氟甲氧基、二氯-氟甲氧基、三

氟甲氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、五氟乙氧基、N-甲氧基亞胺基甲基、1-(N-甲氧基亞胺基)-乙基、甲基氫硫基、甲基磺醯基、甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基氫硫基和 N,N-二甲基胺基。

實施方式 61：根據實施方式 1 至 58 中任一項所述之化合物或鹽，其中

Q 係選自 1-氰基-環丙基、1-羥羰基-環丙基、苄基、環丙基、2-噻吩基甲基、吡啶-4-基、2,2,2-三氟乙基、甲基磺醯基、噻唑-3-基、1-胺基硫代甲醯基環丙基和 1-胺基甲醯基環丙基。

實施方式 61.1：根據實施方式 1 至 58 中任一項所述之化合物或鹽，其中

Q 係選自環丙基、1-氰基-環丙基、1-(C(=O)-NH₂)-環丙基、1-(C(=S)-NH₂)-環丙基、1-(三氟甲基)-環丙基、2-氟-環丙基和 2-(三氟甲基)-環丙基。

實施方式 61.2：根據實施方式 1 至 58 中任一項所述之化合物或鹽，其中

Q 係選自環丙基、1-氰基-環丙基、2-氟-環丙基和 2-(三氟甲基)-環丙基。

實施方式 62：根據實施方式 1 至 61 中任一項所述之化合物或鹽，其中 W 係 O。

實施方式 63：根據實施方式 1 至 62 中任一項所述之化合物或鹽，其中

R^{6a}、R^{7a}和 R^{8a}係獨立地選自 H、鹵素、氰基、硝基、胺基、甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、三級丁基、三氟甲基、二氟甲基、甲氧基、乙氧基、三氟甲氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、甲基羰基、乙基羰基、三氟甲基羰基、甲基氫硫基、甲基亞磺醯基、甲基磺醯基、三氟甲基磺醯基、

三氟甲基氫硫基和三氟甲基亞磺基；

R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 係獨立地選自 H 或甲基。

實施方式 63.1：根據實施方式 1 至 62 中任一項所述之化合物或鹽，其中

R^{6a} 、 R^{7a} 、 R^{8a} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 係獨立地選自 H、氯、溴、氟、甲基、三氟甲基、甲氧基和氰基；

R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 係獨立地選自 H 或甲基。

實施方式 63.3：根據實施方式 1 至 62 中任一項所述之化合物或鹽，其中

R^{6a} 、 R^{7a} 、 R^{8a} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 係獨立地選自 H、氯、氟、甲基、三氟甲基、甲氧基和氰基；

R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 係獨立地選自 H 和甲基。

實施方式 64：根據實施方式 1 至 62 中任一項所述之化合物或鹽，其中

R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} 係獨立地選自 H、甲基、氯、溴、三氟甲基和三氟甲氧基；

R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 係獨立地選自 H 和甲基。

實施方式 65：根據實施方式 1 至 64 中任一項所述之化合物或鹽，其中

Z^1 係選自甲基、乙基、1,1-二甲基乙基、二氟甲基、三氟甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、溴二氯甲基、1-氟乙基、1-氟-1-甲基乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,2,2,2-四氟乙基、1-氯-1,2,2,2-四氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、1,1-二氟乙基、五氟乙基、七氟-正丙基、七氟-異丙基、九氟-正丁基、環丙基、1-氯環丙基、1-氟環丙基、1-溴環丙基、1-氰基-環丙基、1-三氟甲基-環丙基、環丁基和 2,2-二氟-1-甲基

-環丙基；

Z^2 係選自 H、鹵素、氰基、硝基、胺基、甲基、乙基、1,1-二甲基乙基、二氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、溴二氯甲基、1-氟乙基、1-氟-1 甲基乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,2,2,2-四氟乙基、1-氯-1,2,2,2-四氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、1,1-二氟乙基、五氟乙基、七氟-正丙基、七氟-異丙基、九氟-正丁基、甲基氫硫基、甲基亞磺基、甲基磺基、乙硫基、乙基亞磺基、乙基磺基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺基、三氟甲基磺基、氯-二氟甲基氫硫基、氯-二氟甲基亞磺基、氯-二氟甲基磺基、二氯-氟甲基氫硫基、二氯-氟甲基亞磺基、二氯-氟甲基磺基；並且

Z^3 係選自 H、甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、二級丁基、三級丁基、乙烯基、1-丙烯基、1-丙炔基、1-丁炔基、二氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、1 氟-1-甲基乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、苯基、2-氯苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、2,5-二氯苯基、3,4-二氯苯基、2,6-二氯苯基、2,6-二氯-4-三氟甲基苯基、3-氯-5-三氟甲基吡啶-2-基、4-NO₂-苯基和 3-氯-吡啶-2-基。

實施方式 65.1：根據實施方式 1 至 64 中任一項所述之化合物或鹽，其中

Z^1 係選自 C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷氧基其中每個 C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷氧基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素的取代基取代的；

Z^2 係選自 C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷基，其中每個 C₁-C₆-烷氧基和 C₁-C₆-烷基

係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素的取代基取代的；

Z^3 係選自甲基、乙基、環丙基、正丙基和 H。

實施方式 65.2：根據實施方式 1 至 64 中任一項所述之化合物或鹽，其中

Z^1 係選自 $-\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_2\text{CFCF}_3$ 和 $-\text{OCF}_2\text{CFOCF}_3$ ；

Z^2 係 $-\text{CF}_3$ 或 $-\text{OCF}_2\text{H}$ ；

Z^3 係選自甲基、乙基、環丙基、正丙基和 H，特別是甲基。

實施方式 66：根據實施方式 1 至 64 中任一項所述之化合物或鹽，其中

Z^1 係 CF_2CF_3 ；

Z^2 係 CF_3 或 $-\text{OCF}_2\text{H}$ ；

Z^3 係選自甲基、乙基、環丙基、正丙基和 H，特別是甲基。

實施方式 66.1：根據實施方式 1 至 64 中任一項所述之化合物或鹽，其中

Z^1 係 $-\text{OCF}_2\text{CFHCF}_3$ ；

Z^2 係 $-\text{CF}_3$ 或 $-\text{OCF}_2\text{H}$ ；

Z^3 係甲基。

實施方式 66.2：根據實施方式 1 至 64 中任一項所述之化合物或鹽，其中

Z^1 係 $-\text{OCF}_2\text{CFHO}\text{CF}_3$ ；

Z^2 係 $-\text{CF}_3$ 或 $-\text{OCF}_2\text{H}$ ；

Z^3 係甲基。

實施方式 66.3：根據實施方式 1 至 64 中任一項所述之化合物或鹽，其

中

Z^1 係 $-CF_2CF_3$ ；

Z^2 係 $-CF_3$ 或 $-OCF_2H$ ；

Z^3 係甲基。

實施方式 67：根據實施方式 1 至 55 中任一項所述之化合物或鹽，其中

R^1 係 H、甲基或乙基；

Q 係選自 1-氰基-環丙基、苄基、環丙基、2-噻吩基甲基、1-胺基硫代甲醯基環丙基、1-羥羰基-環丙基、吡啶-4-基、2,2,2-三氟乙基、甲基磺醯基、噻唑-3-基和 1-胺基甲醯基環丙基；

W 係 O；

如果存在的話， R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} 係獨立地選自 H、甲基、氯、溴、三氟甲基和三氟甲氧基；

如果存在的話， R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 係獨立地選自 H 和甲基；

Z^1 係選自甲基、乙基、1,1-二甲基乙基、二氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、溴二氯甲基、1-氟乙基、1-氟-1-甲基乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,2,2,2-四氟乙基、1-氯-1,2,2,2-四氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、1,1-二氟乙基、五氟乙基、七氟-正丙基、七氟-異丙基、九氟-正丁基、環丙基、1-氯環丙基、1-氟環丙基、1-溴環丙基、1-氰基-環丙基、1-三氟甲基-環丙基、環丁基和 2,2-二氟-1-甲基-環丙基；

Z^2 係選自 H、鹵素、氰基、硝基、胺基、甲基、乙基、1,1-二甲基乙基、二氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、溴二氯甲基、

1-氟乙基、1-氟-1 甲基乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,2,2,2-四氟乙基、1-氯-1,2,2,2-四氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、1,1-二氟乙基、五氟乙基七氟-正丙基、七氟-異丙基、九氟-正丁基、甲基氫硫基、甲基亞磺基、甲基磺基、乙硫基、乙基亞磺基、乙基磺基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺基、三氟甲基磺基、氯-二氟甲基氫硫基、氯-二氟甲基亞磺基、氯-二氟甲基磺基、二氯-氟甲基氫硫基、二氯-氟甲基亞磺基和二氯-氟甲基磺基；

Z³係選自 H、甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、二級丁基、三級丁基、乙烯基、1-丙烯基、1-丙炔基、1-丁炔基、二氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、1 氟-1-甲基乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、苯基、2-氯苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、2,5-二氯苯基、3,4-二氯苯基、2,6-二氯苯基、2,6-二氯-4-三氟甲基苯基、3-氯-5-三氟甲基吡啶-2-基、4-NO₂-苯基和 3-氯-吡啶-2-基。

實施方式 67.1：根據實施方式 1 至 55 中任一項所述之化合物或鹽，其中

R¹ 係 H、甲基或乙基；

Q 係選自 1-氰基-環丙基、苄基、環丙基、2-噻吩基甲基、1-胺基硫代甲酯基環丙基、1-(C(=O)-NH₂)-環丙基、1-(C(=S)-NH₂)-環丙基、1-羥羰基-環丙基、吡啶-4-基、2,2,2-三氟乙基、甲基磺基、噻唑-3-基和 1-胺基甲酯基環丙基；

W 係 O；

如果存在的話，R^{6a}、R^{7a} 和 R^{8a} 係獨立地選自 H、甲基、氯、溴、三氟甲

基和三氟甲氧基；

如果存在的話， R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 係獨立地選自 H 和甲基；

Z^1 係選自甲基、乙基、1,1-二甲基乙基、二氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、溴二氯甲基、1-氟乙基、1-氟-1-甲基乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,2,2,2-四氟乙基、1-氯-1,2,2,2-四氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、1,1-二氟乙基、五氟乙基、3,3,3,3,2,1,1-六氟丙氧基、2-三氟甲氧基-2,1,1-三氟乙氧基、七氟-正丙基、七氟-異丙基、九氟-正丁基、環丙基、1-氯環丙基、1-氟環丙基、1-溴環丙基、1-氟基-環丙基、1-三氟甲基-環丙基、環丁基和 2,2-二氟-1-甲基-環丙基；

Z^2 係選自 H、鹵素、氰基、硝基、胺基、甲基、乙基、1,1-二甲基乙基、二氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、溴二氯甲基、1-氟乙基、1-氟-1-甲基乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,2,2,2-四氟乙基、1-氯-1,2,2,2-四氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、1,1-二氟乙基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、五氟乙基、七氟-正丙基、七氟-異丙基、九氟-正丁基、甲基氫硫基、甲基亞磺醯基、甲基磺醯基、乙硫基、乙基亞磺醯基、乙基磺醯基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、氯-二氟甲基氫硫基、氯-二氟甲基亞磺醯基、氯-二氟甲基磺醯基、二氯-氟甲基氫硫基、二氯-氟甲基亞磺醯基、二氯-氟甲基磺醯基；並且

Z^3 係選自 H、甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、二級丁基、三級丁基、乙烯基、1-丙烯基、1-丙炔基、1-丁炔基、二氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、1-氟-1-甲基乙基、

2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、苯基、2-氯苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、2,5-二氯苯基、3,4-二氯苯基、2,6-二氯苯基、2,6-二氯-4-三氟甲基苯基、3-氯-5-三氟甲基吡啶-2-基、4-NO₂-苯基和 3-氯-吡啶-2-基。

實施方式 67.2：根據實施方式 1 至 55 中任一項所述之化合物或鹽，其中

R¹ 係 H、甲基或乙基；

Q 係選自環丙基、1-氰基-環丙基、1-(C(=O)-NH₂)-環丙基、1-(C(=S)-NH₂)-環丙基、1-(三氟甲基)-環丙基、2-氟-環丙基和 2-(三氟甲基)-環丙基；

W 係 O；

如果存在的話，R^{6a}、R^{7a}和 R^{8a}係獨立地選自 H、氯、溴、氟、甲基、三氟甲基、甲氧基和氰基；

如果存在的話，R^{6b}、R^{7b}和 R^{8b}係獨立地選自 H 和甲基；

Z¹ 係選自 C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵烷氧基和 C₁-C₆-鹵烷基其中每個 C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵烷氧基和 C₁-C₆-鹵烷基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、C₁-C₆-烷氧基和 C₁-C₆-鹵烷氧基的取代基取代的；

Z² 係選自 C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷基，其中每個 C₁-C₆-烷氧基和 C₁-C₆-烷基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素的取代基取代的；

Z³ 係選自甲基、乙基、環丙基、正丙基和 H。

實施方式 68：根據實施方式 1 至 55 中任一項所述之化合物或鹽，其中

R¹ 係 H、甲基或乙基；

Q 係選自 1-氰基-環丙基、1-羥羰基-環丙基、苄基、環丙基、2-噻吩基甲基、1-胺基硫代甲醯基環丙基、吡啶-4-基、2,2,2-三氟乙基、甲基磺醯基、

噻唑-3-基和 1-胺基甲醯基環丙基；

W 係 O；

如果存在的話， R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} 係獨立地選自 H、甲基、氯、溴、三氟甲基和三氟甲氧基；

如果存在的話， R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 係獨立地選自 H 和甲基；

Z^1 係 CF_2CF_3 ；

Z^2 係 CF_3 ；

Z^3 係 H、甲基或乙基。

實施方式 68.1：根據實施方式 1 至 55 中任一項所述之化合物或鹽，其中

R^1 係 H、甲基或乙基；

Q 係選自環丙基、1-氰基-環丙基、2-氟-環丙基和 2-(三氟甲基)-環丙基；

W 係 O；

如果存在的話， R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} 係獨立地選自 H、氯、氟、甲基、三氟甲基、甲氧基和氰基；

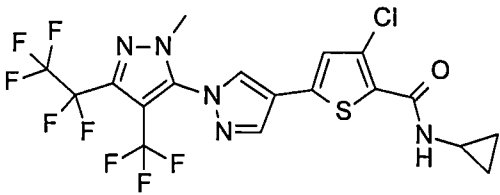
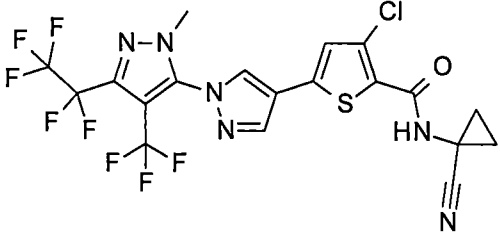
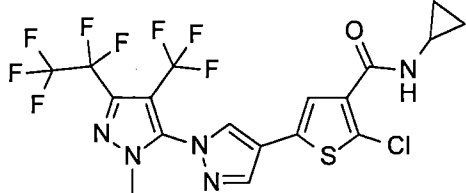
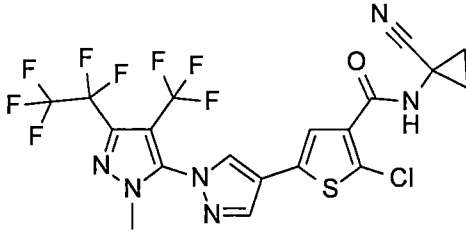
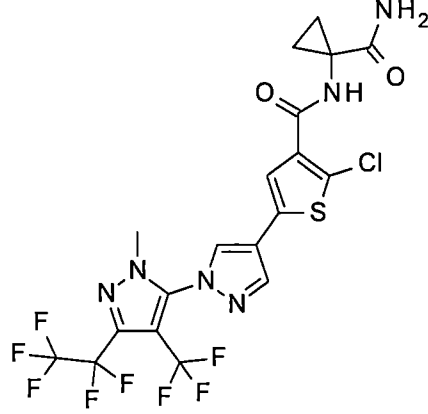
如果存在的話， R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 係獨立地選自 H 和甲基；

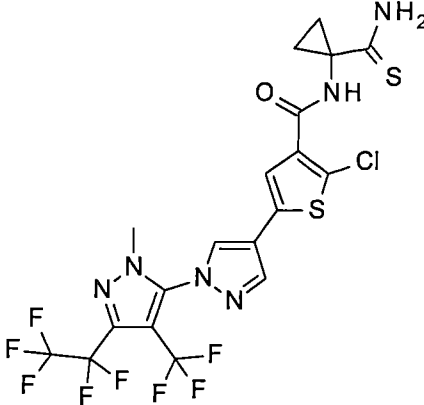
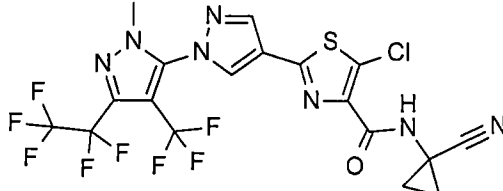
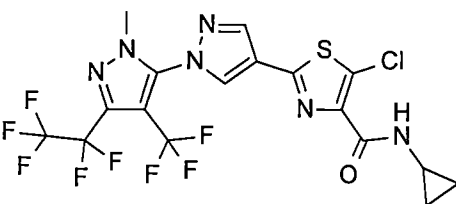
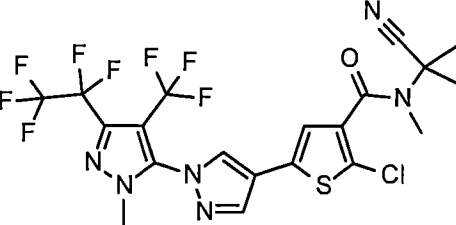
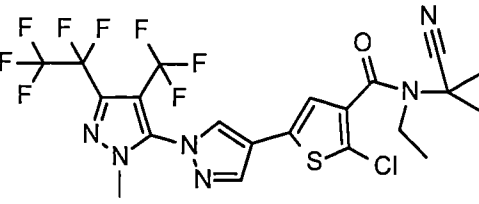
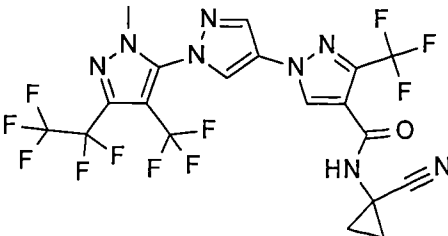
Z^1 係 CF_2CF_3 、 $-OCF_2CFCF_3$ 或 $-OCF_2CFOCF_3$ ；

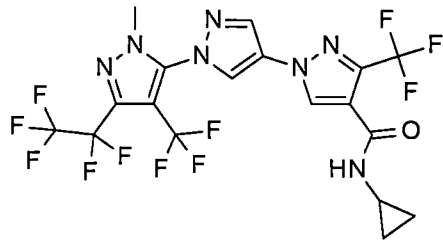
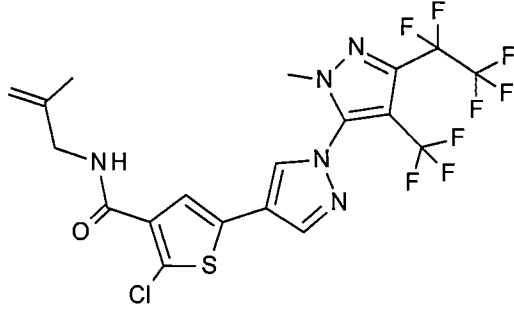
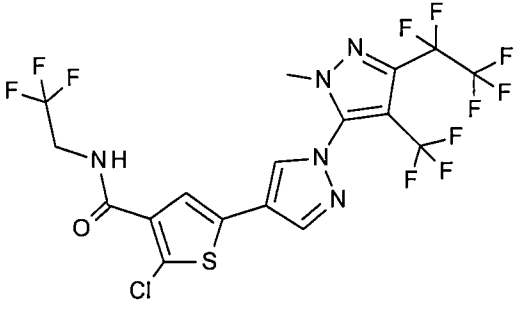
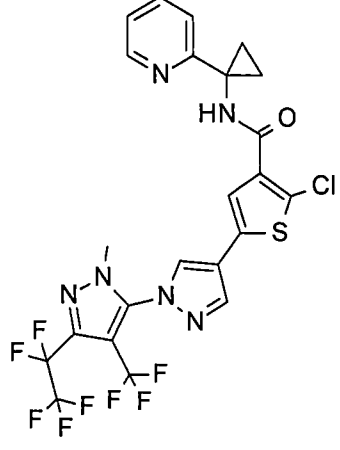
Z^2 係 CF_3 或 OCF_2H ；

Z^3 係甲基。

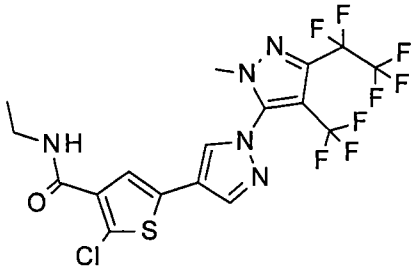
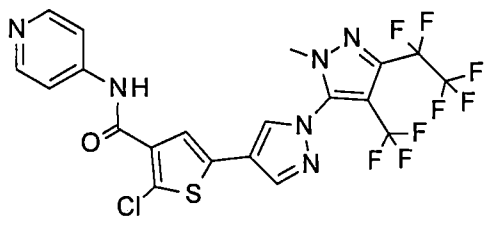
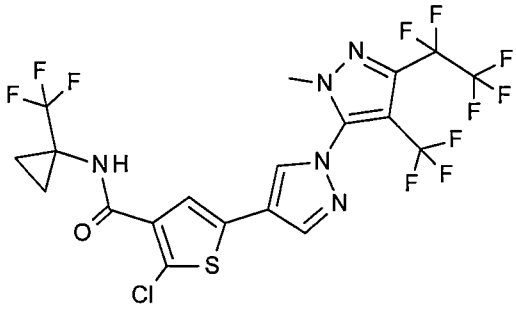
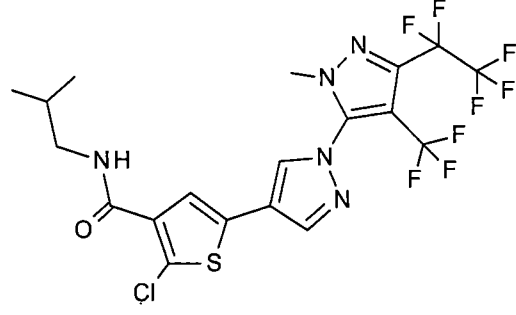
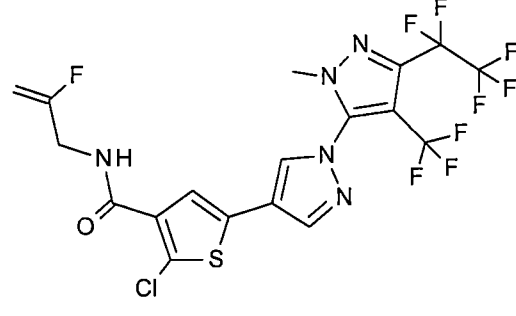
實施方式 69：根據實施方式 1 所述的化合物或鹽選自

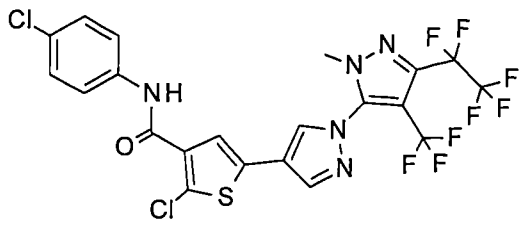
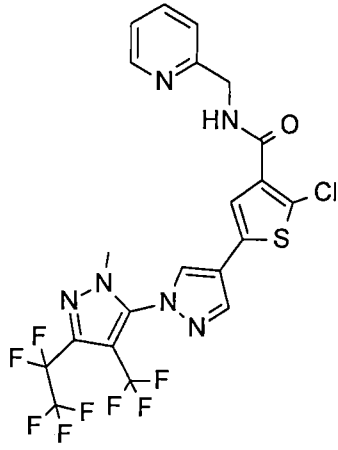
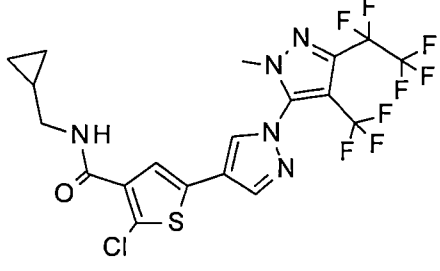
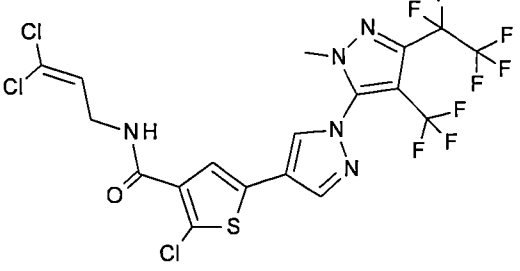
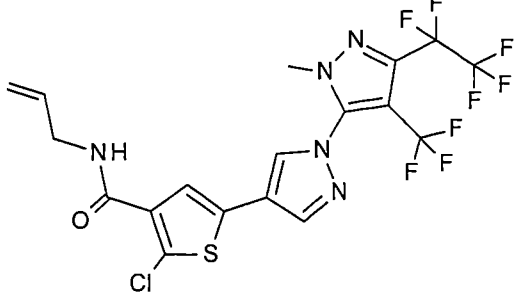
Ex.編號	結構
1	
2	
3	
4	
5	

Ex.編號	結構
6	
7	
8	
9	
10	
11	

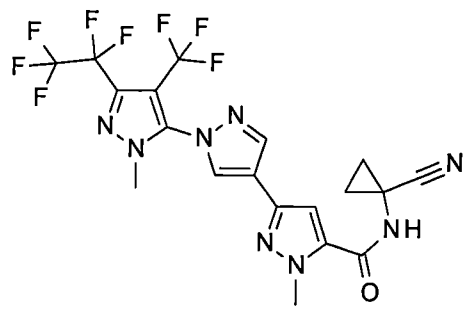
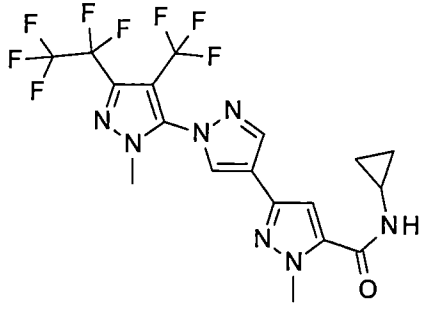
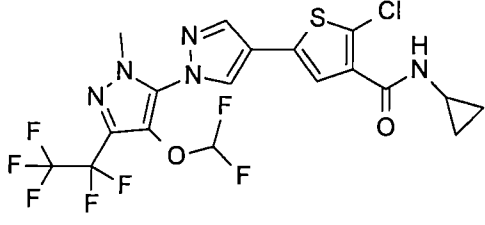
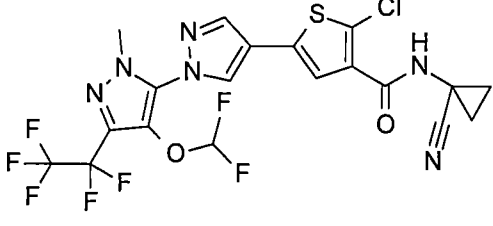
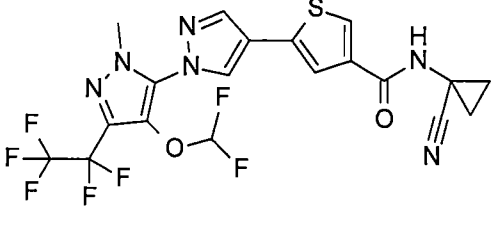
Ex.編號	結構
12	
13	
14	
15	

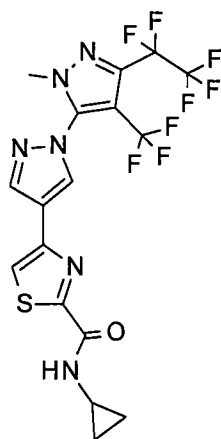
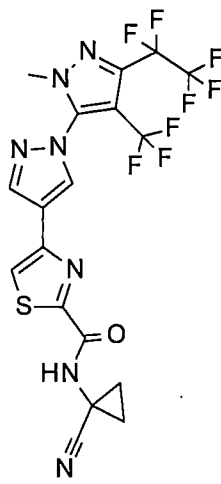
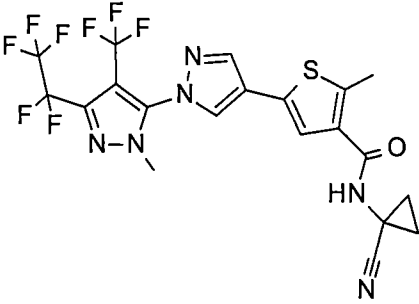
Ex.編號	結構
16	<chem>Cn1nnc(c1)-c2cc(s2)C(=O)Nc3cc(Cl)cc3</chem>
17	<chem>Cn1nnc(c1)-c2cc(s2)C(=O)Nc3cc(Cl)cc3</chem>
18	<chem>Cn1nnc(c1)-c2cc(s2)C(=O)Nc3cc(Cl)cc3</chem>
19	<chem>Cn1nnc(c1)-c2cc(s2)C(=O)Nc3cc(Cl)cc3</chem>

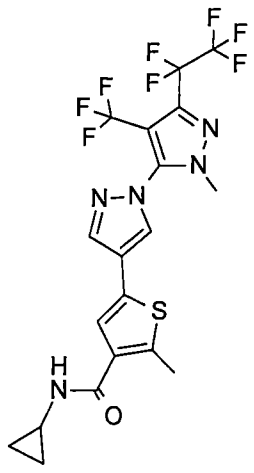
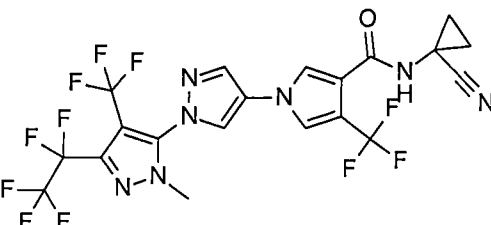
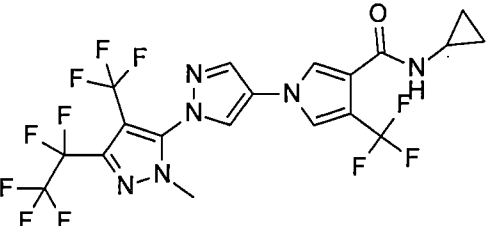
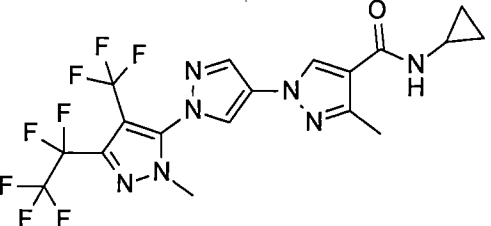
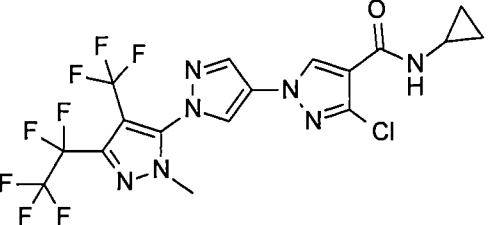
Ex.編號	結構
20	
21	
22	
23	
24	

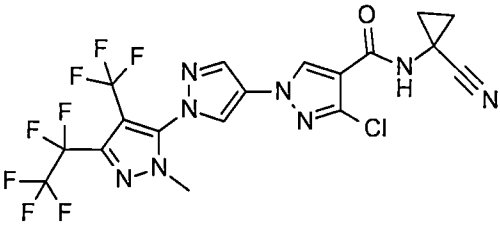
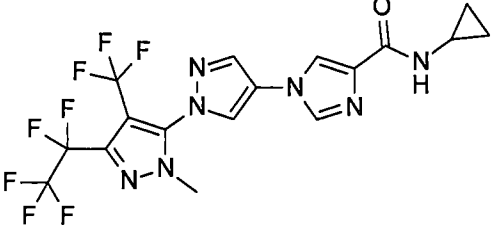
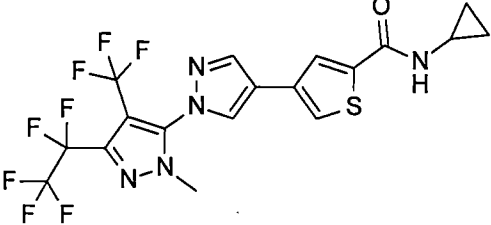
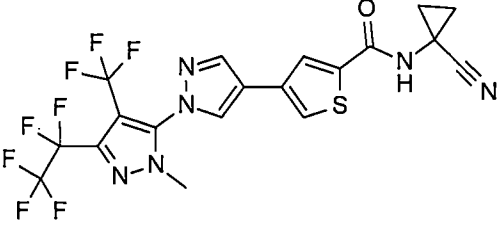
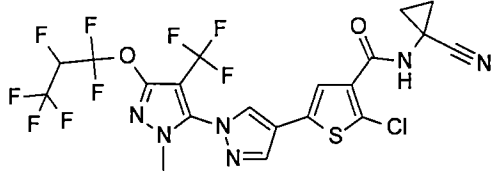
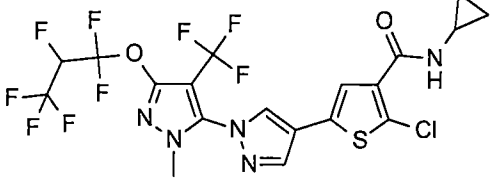
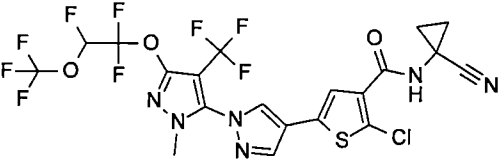
Ex.編號	結構
25	
26	
27	
28	
29	

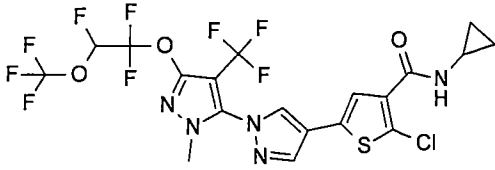
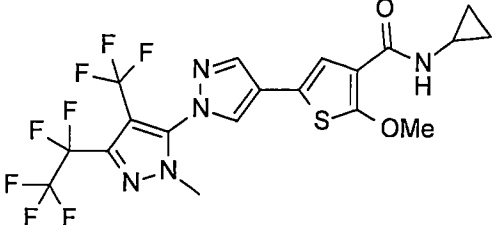
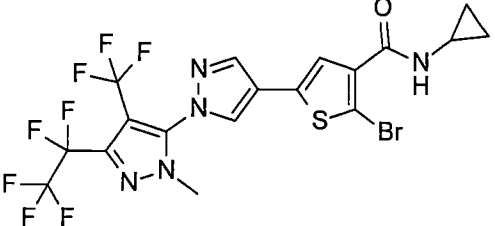
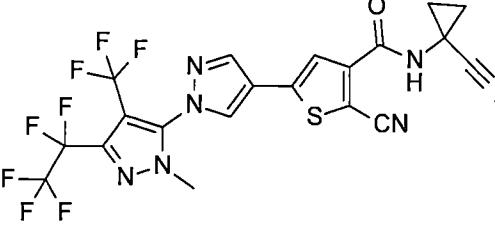
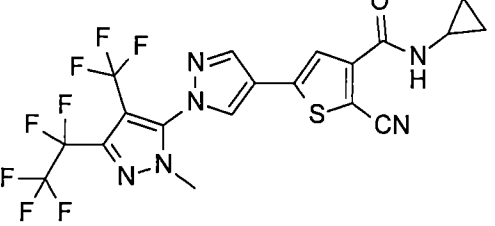
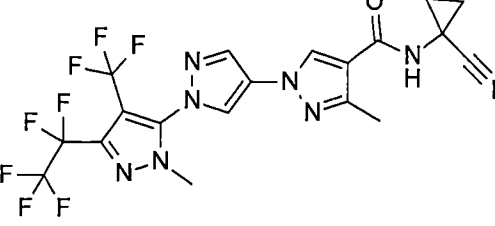
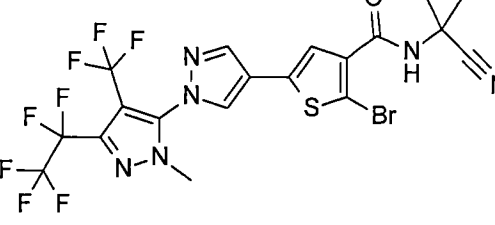
Ex.編號	結構
30	<chem>CC(F)(F)FCCNC(=O)c1cc(Cl)sc1-c1ccnnc1C(F)(F)C(F)(F)C(F)(F)F</chem>
31	<chem>CC(F)(F)C(F)(F)C(F)(F)F-c1ccnnc1-c1cc2sc(C(=O)NCC=C)cc2cc1Cl</chem>
32	<chem>C1CC1NCC(=O)c1cc(Cl)sc1-c1ccnnc1C(F)(F)C(F)(F)C(F)(F)F</chem>
33	<chem>C1CC1NCC(=O)c1cc(Cl)sc1-c1ccnnc1C(F)(F)C(F)(F)C(F)(F)F</chem>
34	<chem>CC(F)(F)C(F)(F)C(F)(F)F-c1ccnnc1-c1cc2sc(C(=O)NCC#C)cc2cc1Cl</chem>

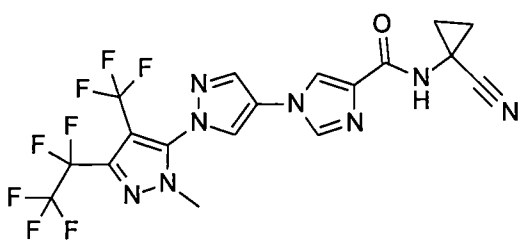
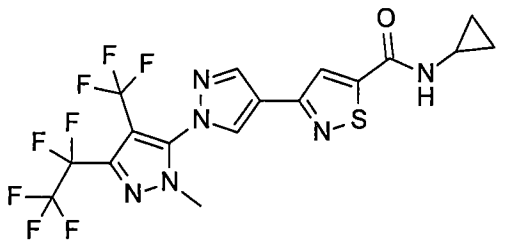
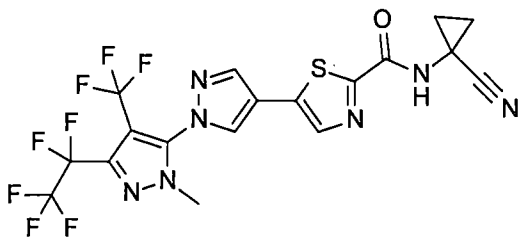
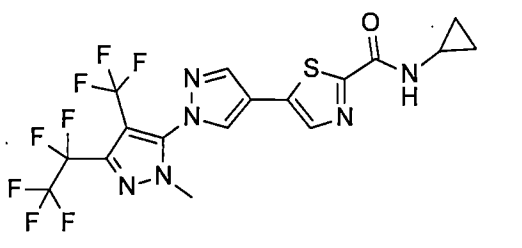
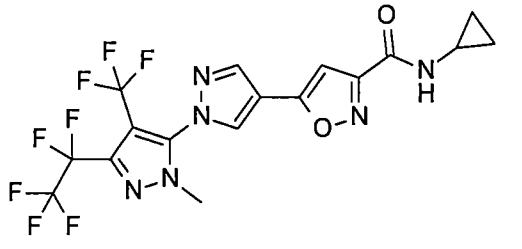
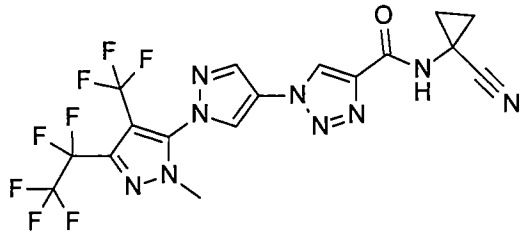
Ex.編號	結構
35	
36	
37	
38	
39	

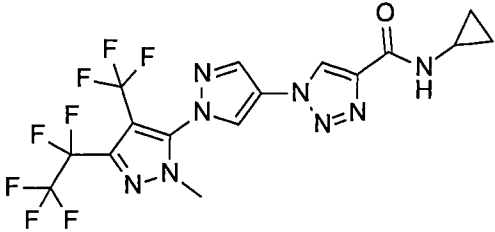
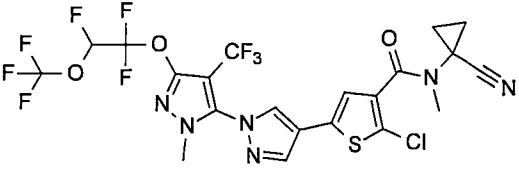
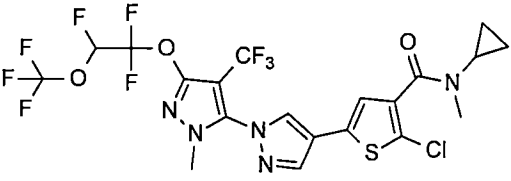
Ex.編號	結構
40	
41	
42	

Ex.編號	結構
43	
44	
45	
46	
47	

Ex.編號	結構
48	
49	
50	
51	
52	
53	
54	

Ex.編號	結構
55	
56	
57	
58	
59	
60	
61	

Ex.編號	結構
62	
63	
64	
65	
66	
67	

Ex.編號	結構
68	
69	
70	

或其農用化學上可接受的鹽或 N-氧化物。

【0006】 術語“本發明的一種或多種化合物”或“本發明的化合物”如在此所用，係指如在實施方式 1 至 69 中任一項所定義的化合物。

定義：

【0007】 術語“烷基”如在此所用-孤立地或作為化學基團的一部分-表示直鏈或支鏈的烴，較佳的是具有 1 至 6 個碳原子，例如甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、二級丁基、三級丁基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、1,2-二甲基丙基、1,1-二甲基丙基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、己基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,2-二甲基丙基、1,3-二甲基丁基、1,4-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、1,1-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基丁基和 2-乙基丁基。具有 1 至 4 個碳原子的烷基係較佳的，例如甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、二級丁

基或三級丁基。

【0008】 術語“烯基”-孤立地或作為化學基團的一部分-表示直鏈或支鏈的烴，較佳的是具有 2 至 6 個碳原子和至少一個雙鍵，例如乙烯基、2-丙烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-2-戊烯基、4-甲基-2-戊烯基、3-甲基-3-戊烯基、4-甲基-3-戊烯基、1-甲基-4-戊烯基、2-甲基-4-戊烯基、3-甲基-4-戊烯基、4-甲基-4-戊烯基、1,1-二甲基-2-丁烯基、1,1-二甲基-3-丁烯基、1,2-二甲基-2-丁烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-乙基-2-丁烯基、2-乙基-3-丁烯基、1,1,2-三甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯基和 1-乙基-2-甲基-2-丙烯基。具有 2 至 4 個碳原子的烯基係較佳的，例如 2-丙烯基、2-丁烯基或 1-甲基-2-丙烯基。

【0009】 術語“炔基”-孤立地或作為化學基團的一部分-表示直鏈或支鏈的烴，較佳的是具有 2 至 6 個碳原子和至少一個三鍵，例如 2-丙炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、1-甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基、1-乙基-2-丙炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、1-甲基-2-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-3-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、

3-甲基-4-戊炔基、4-甲基-2-戊炔基、1,1-二甲基-3-丁炔基、1,2-二甲基-3-丁炔基、2,2-二甲基-3-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-乙基-3-丁炔基、1-乙基-1-甲基、1,2-丙炔基和 2,5-己二炔基。具有 2 至 4 個碳原子的炔基係較佳的，例如乙炔基、2-丙炔基或 2-丁炔基-2-丙炔基。

【0010】 術語“環烷基”-孤立地或作為化學基團的一部分-表示飽和的或部分不飽和的單環、二環或三環的烴，較佳的是 3 至 10 個碳原子，例如環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基、環辛基、二環[2.2.1]庚基、二環[2.2.2]辛基或金剛烷基。

【0011】 具有 3、4、5、6 或 7 個碳原子的環烷基係較佳的，例如環丙基或環丁基。

【0012】 術語“雜環烷基”-孤立地或作為化學基團的一部分-表示飽和的或部分不飽和的單環、二環或三環的烴，較佳的是 3 至 10 個碳原子，例如環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基、環辛基、二環[2.2.1]庚基、二環[2.2.2]辛基或金剛烷基，其中環原子的一個或多個，環原子的較佳的是 1 至 4 個，更較佳的是 1、2 或 3 個係獨立地選自 N、O、S、P、B、Si 以及 Se，更較佳的是 N、O 和 S，其中沒有 O 原子可以彼此相鄰定位。

【0013】 術語“烷基環烷基”代表單環、雙環或三環的烷基環烷基，較佳的是具有 4 至 10 個或 4 至 7 個碳原子，例如乙基環丙基、異丙基環丁基、3-甲基環戊基和 4-甲基-環己基。具有 4、5 或 7 個碳原子的烷基環烷基係較佳的，例如乙基環丙基或 4-甲基-環己基。

【0014】 術語“環烷基烷基”代表單環、二環或三環的環烷基烷基，較佳的是 4 至 10 個或 4 至 7 個碳原子，例如環丙基甲基、環丁基甲基、環

戊基甲基、環己基甲基和環戊基乙基。具有 4、5 或 7 個碳原子的環烷基烷基係較佳的，例如環丙基甲基或環丁基甲基。

【0015】 術語“鹵素”或“鹵基”表示氟、氯、溴或碘，特別是氟、氯或溴。被鹵素取代的化學基團，例如鹵烷基、鹵環烷基、鹵烷氧基、鹵代烷基氫硫基、鹵代烷基亞磺醯基或鹵代烷基磺醯基係被鹵素取代一次或直到最大數量的取代基。如果“烷基”，“烯基”或“炔基”被鹵素取代，則鹵素原子可以是相同或不同的並且可以是結合在同一碳原子或者不同的碳原子上。

【0016】 術語“鹵代環烷基”或“鹵環烷基”表示單環、二環或三環的鹵代環烷基，較佳的是具有 3 至 10 個碳原子，例如 1-氟-環丙基、2-氟-環丙基或 1-氟-環丁基。較佳的鹵代環烷基具有 3、5 或 7 個碳原子。

【0017】 術語“鹵代烷基”、“鹵烷基”、“鹵代烯基”、“鹵烯基”、“鹵代炔基”或“鹵炔基”表示被鹵素取代的烷基、烯基或炔基，較佳的是被 1 至 9 個相同或不同的鹵素原子取代，例如單鹵烷基 (= 單鹵代烷基)像 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 CHClCH_3 、 CHFCH_3 、 CH_2Cl 、 CH_2F ；全鹵烷基像 CCl_3 或 CF_3 或 CF_2CF_3 ；多鹵烷基像 CHF_2 、 CH_2F 、 CH_2CHFCl 、 $\text{CF}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 CH_2CF_3 。這同樣適用於被鹵素取代的鹵烯基和其他基團。

【0018】 鹵烷氧基的實例係例如 OCF_3 、 OCHF_2 、 OCH_2F 、 OCF_2CF_3 、 OCH_2CF_3 、 OCF_3 、 OCHF_2 、 OCH_2F 、 OCF_2CF_3 、 OCH_2CF_3 。

【0019】 鹵烷基的進一步實例係三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、五氟乙基和五氟-三級丁基。

【0020】 具有 1 至 4 個碳原子和 1 至 9 個、較佳的是 1 至 5 個相同或不同的選自氟、氯或溴的鹵素原子的鹵代烷基係較佳的。

【0021】 具有 1 或 2 個碳原子和 1 至 5 個相同或不同的選自氟或氯的鹵素原子的鹵代烷基，例如二氟甲基、三氟甲基或 2,2-二氟乙基，係特別較佳的。

【0022】 術語“羧烷基”表示直鏈或支鏈的醇，較佳的是具有 1 至 6 個碳原子，例如甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、二級丁醇和三級丁醇。具有 1 至 4 個碳原子的羧烷基係較佳的。

【0023】 術語“烷氧基”表示直鏈或支鏈的 O-烷基，較佳的是具有 1 至 6 個碳原子，例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、異丁氧基、二級丁氧基和三級丁氧基。具有 1 至 4 個碳原子的烷氧基係較佳的。

【0024】 術語“鹵代烷氧基”表示直鏈或支鏈的被鹵素取代的 O-烷基，較佳的是具有 1 至 6 個碳原子，例如二氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2-二氟乙氧基、1,1,2,2-四氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基和 2-氯-1,1,2-三氟乙氧基。

【0025】 具有 1 至 4 個碳原子的鹵代烷氧基係較佳的。

【0026】 術語“烷基氫硫基”表示直鏈或支鏈的 S-烷基，較佳的是具有 1 至 6 個碳原子，例如甲硫基、乙硫基、正丙硫基、異丙硫基、正丁硫基、異丁硫基、二級丁硫基和三級丁硫基。具有 1 至 4 個碳原子的烷基氫硫基係較佳的。鹵代烷基氫硫基，即被鹵素取代的烷基氫硫基的實例係例如二氟甲硫基、三氟甲硫基、三氯甲硫基、氯二氟甲硫基、1-氟乙硫基、2-氟乙硫基、2,2-二氟乙硫基、1,1,2,2-四氟乙硫基、2,2,2-三氟乙硫基或 2-氯

-1,1,2-三氟乙硫基。

【0027】 術語“烷基亞磺醯基”表示直鏈或支鏈的烷基亞磺醯基，較佳的是具有 1 至 6 個碳原子，例如甲基亞磺醯基、乙基亞磺醯基、正丙基亞磺醯基、異丙基亞磺醯基、正丁基亞磺醯基、異丁基亞磺醯基、二級丁基亞磺醯基和三級丁基亞磺醯基。

【0028】 具有 1 至 4 個碳原子的烷基亞磺醯基係較佳的。

【0029】 鹵代烷基亞磺醯基，即被鹵素取代的烷基亞磺醯基的實例係二氟甲基亞磺醯基、三氟甲基亞磺醯基、三氯甲基亞磺醯基、氯二氟甲基亞磺醯基、1-氟乙基亞磺醯基、2-氟乙基亞磺醯基、2,2-二氟乙基亞磺醯基、1,1,2,2-四氟乙基亞磺醯基、2,2,2-三氟乙基亞磺醯基和 2-氯-1,1,2-三氟乙基亞磺醯基。

【0030】 術語“烷基磺醯基”表示直鏈或支鏈的烷基磺醯基，較佳的是具有 1 至 6 個碳原子，例如甲基磺醯基、乙基磺醯基、正丙基磺醯基、異丙基磺醯基、正丁基磺醯基、異丁基磺醯基、二級丁基磺醯基和三級丁基磺醯基。

【0031】 具有 1 至 4 個碳原子的烷基磺醯基係較佳的。

【0032】 鹵代烷基磺醯基，即被鹵素取代的烷基磺醯基的實例係二氟甲基磺醯基、三氟甲基磺醯基、三氯甲基磺醯基、氯二氟甲基磺醯基、1-氟乙基磺醯基、2-氟乙基磺醯基、2,2-二氟乙基磺醯基、1,1,2,2-四氟乙基磺醯基、2,2,2-三氟乙基磺醯基和 2-氯-1,1,2-三氟乙基磺醯基。

【0033】 術語“烷基羰基”表示直鏈或支鏈的烷基-C(=O)，較佳的是具有 2 至 7 個碳原子，例如甲基羰基、乙基羰基、正丙基羰基、異丙基羰

基、二級丁基羰基和三級丁基羰基。

【0034】 具有 1 至 4 個碳原子的烷基羰基係較佳的。

【0035】 術語“環烷基羰基”表示環烷基 - 羰基，較佳的是在環烷基部分中 3 至 10 個碳原子，例如環丙基羰基、環丁基羰基、環戊基羰基、環己基-羰基、環庚基-羰基、環辛基羰基、二環[2.2.1]庚基、二環[2.2.2]辛基羰基和金剛烷基羰基。在環烷基部分中具有 3、5 或 7 個碳原子的環烷基羰基係較佳的。

【0036】 術語“烷氧基羰基”-孤立地或作為化學基團的一部分-表示直鏈或支鏈烷基-O-C(=O)-，較佳的是在烷氧基部分中具有 1 至 6 個碳原子或 1 至 4 個碳原子，例如甲氧基羰基、乙氧基羰基、正丙氧基羰基、異丙氧基羰基、二級丁氧基羰基和三級丁氧基羰基。

【0037】 術語“烷基胺基羰基”表示在烷基部分中具有較佳的是 1 至 6 個碳原子或 1 至 4 個碳原子的直鏈或支鏈烷基-NH-C(=O)-，例如甲基胺基羰基、乙基胺基羰基、正丙基胺基羰基、異丙基-胺基羰基、二級丁基胺基羰基和三級丁基胺基羰基。

【0038】 術語“N,N-二烷基胺基-羰基”表示在烷基部分中具有較佳的是 1 至 6 個碳原子或 1 至 4 個碳原子的直鏈或支鏈 N,N-二烷基胺基羰基，例如 N,N-二甲基胺基-羰基、N,N-二乙基胺基-羰基、N,N-二(正丙基胺基)-羰基、N,N-二-(異丙基胺基)-羰基和 N,N-二-(二級丁基胺基)-羰基。

【0039】 術語“芳基”表示具有較佳的是 6 至 14 個、更較佳的是 6 至 10 個環碳原子的單環、二環或多環的芳香族系統，例如苯基、萘基、蒽基、菲基，較佳的是苯基。“芳基”還表示多環系統，例如四氫萘基、茚

基、二氫茛基、萘基、聯苯基。芳烷基係取代的芳基的實例，其可以進一步在該芳基或烷基部分二者中被相同或不同的取代基取代。苄基和 1-苯乙基係此類芳烷基的實例。

【0040】 術語“雜環基”、“雜環”或“雜環系統”表示具有至少一個環的碳環系統，在該環中至少一個碳原子被雜原子取代，該雜原子較佳的是選自 N、O、S、P、B、Si、Se，並且該環係飽和的、不飽和的或部分飽和的，並且該環係未取代的或被取代基 Z 取代的，其中連接鍵位於環原子處。除非另外定義，該雜環具有較佳的是 3 至 9 個環原子、較佳的是 3 至 6 個環原子，以及一個或多個、較佳的是 1 至 4 個、更較佳的是 1、2 或 3 個雜原子在該雜環中，該雜原子較佳的是選自 N、O 和 S，其中沒有 O 原子可以彼此相鄰定位。雜環通常含有不超過 4 個氮，和/或不超過 2 個氧原子和/或不超過 2 個硫原子。在該雜環取代基或該雜環被進一步取代的情況下，它可以進一步與其他雜環成環。

【0041】 術語“雜環”還包括多環系統，例如 8-氮雜-雙環[3.2.1]辛烷基或 1-氮雜-雙環[2.2.1]庚基。

【0042】 術語“雜環”還包括螺環系統，例如 1-氧雜-5-氮雜-螺[2.3]己基。

【0043】 雜環基的實例係例如哌啶基、哌嗪基、咪啉基、硫代咪啉基、二氫哌喃基、四氫哌喃基、二噁唑基、吡咯啉基、吡咯啶基、咪唑啉基、咪唑啶基、噻唑啶基、噁唑啶基、間二氧雜環戊基、間二氧雜環戊烯基、吡唑啶基、四氫呋喃基、二氫呋喃基、氧雜環丁基、環氧乙烷基、氮雜環丁基、氮雜環丙基、氧氮雜環丁基、氧氮雜環丙烷基、氧氮雜環庚基、氧

氮雜環己基、氮雜環庚基、側氧基吡咯啉基、二側氧基吡咯啉基、側氧基咪啉基、側氧基哌啶基和氧雜環庚基。

【0044】 特別重要的是雜芳基，即雜芳香族系統。

【0045】 術語“雜芳基”表示雜芳香族基團，即完全不飽和的芳香族雜環基團，其落入上述雜環的定義中。“雜芳基”，具有 5 至 7 員環，該等環具有 1 至 3 個、較佳的是 1 或 2 個相同或不同的選自 N、O 和 S 的雜原子。“雜芳基”的實例係呋喃基，噻吩基，吡啶基，咪唑基，1,2,3-和 1,2,4-三唑基，異噁唑基，噻唑基，異噻唑基，1,2,3-、1,3,4-、1,2,4-和 1,2,5-噁二唑基，氮呋基，吡咯基，吡啶基，嗒吡基，嘧啶基，吡嗪基，1,3,5-、1,2,4-和 1,2,3-三吡基，1,2,4-、1,3,2-、1,3,6-和 1,2,6-噁吡基，氧雜環庚三烯基，硫雜環庚三烯基，1,2,4-三唑酮基和 1,2,4-二氮呋基。

【0046】 根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物，該化合物具有至少一個鹼性中心，可以與以下酸形成例如酸加成鹽，該等酸為：例如強無機酸（例如礦物酸，例如高氯酸、硫酸、硝酸、亞硝酸、磷酸或氫鹵酸），強有機羧酸（例如未取代的或像被鹵素取代的 C₁-C₄ 烷羧酸，例如乙酸（像飽和或不飽和的二羧酸），例如草酸、丙二酸、琥珀酸、馬來酸、富馬酸或鄰苯二甲酸（像羥基羧酸），例如抗壞血酸、乳酸、蘋果酸、酒石酸或檸檬酸，或像苯甲酸），或有機磺酸（例如未經取代的或像被鹵素取代的 C₁-C₄ 烷-或芳基磺酸，例如甲烷-或對甲苯磺酸）。根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物，該化合物具有至少一個鹼性中心，可以例如與鹼形成鹽，例如礦物鹽，例如鹼金屬或鹼土金屬鹽，例如鈉鹽、鉀鹽或鎂鹽；或與氨或有機胺形成鹽，該有機胺為例如咪啉、哌啶、吡咯啉、單、二或三

低碳數烷基胺，例如乙胺、二乙胺、三乙胺或二甲基丙基胺，或單、二或三羥基低碳數烷基胺，例如單乙醇胺、二乙醇胺或三乙醇胺。

【0047】 根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物還包括在鹽形成的過程中可以形成的水合物。

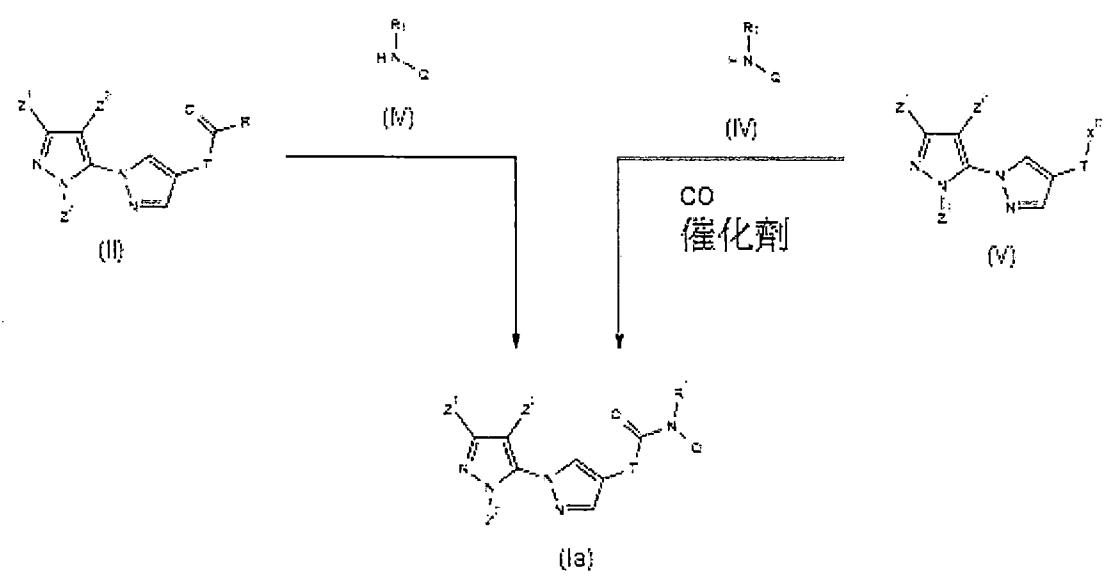
【圖式簡單說明】

無

【0048】 根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物可以由熟習該項技術者熟知的多種方法或如在流程 1 至 4 中所示的製造。關於該製備的另外說明可在 WO 2015/067646、WO 2014/122083 和 WO 2012/107434 中找到。

【0049】 具有式 (I) 之化合物可以，例如，根據流程 1 至 4 製備。

流程 1：



其中 Z¹、Z²、Z³、R¹、Q 和 T 係如在實施方式 1 至 69 中任一項定義的。

1) 如流程 1 中所示的，具有式 (Ia) 之化合物可以藉由將具有式 (II) 之化合物（其中 R 為 OH、C₁-C₆烷氧基或 Cl，F 或 Br）與具有式 (IV) 之胺進

行反應來製備。當 R 為 OH 時，此類反應通常是在適合的偶合劑(例如 *N,N'*-二環己基碳二亞胺 (“DCC”)、1-乙基-3-(3-二甲基胺基-丙基)碳二亞胺鹽酸鹽 (“EDC”) 或雙(2-側氧基-3-噁唑啉基)氯化磷 (“BOP-Cl”)) 存在下、在鹼的存在下以及視情況在親核性催化劑 (例如羥基苯並三唑 (“HOBT”)) 的存在下進行。當 R 為 Cl 時，此類反應通常是在鹼的存在下、以及視情況在親核性催化劑存在下進行。可替代地，有可能在包括有機溶劑 (較佳的是乙酸乙酯)、及水性溶劑 (較佳的是碳酸氫鈉溶液) 的雙相系統中進行此反應。當 R 為 C_1 - C_6 烷氧基時，有時有可能藉由在熱過程中一起加熱酯和胺而將酯直接轉換成為醯胺。合適的鹼包括吡啶，三乙胺，4-(二甲基胺基)-吡啶 (“DMAP”) 或二異丙基乙基胺 (胡寧氏鹼 (Hunig' s base))。較佳的溶劑為 *N,N*-二甲基乙醯胺、四氫呋喃、二噁呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、乙酸乙酯和甲苯。該反應係在從 0°C 到 100°C、較佳的是從 15°C 到 30°C 的溫度下、特別是在環境溫度下進行的。

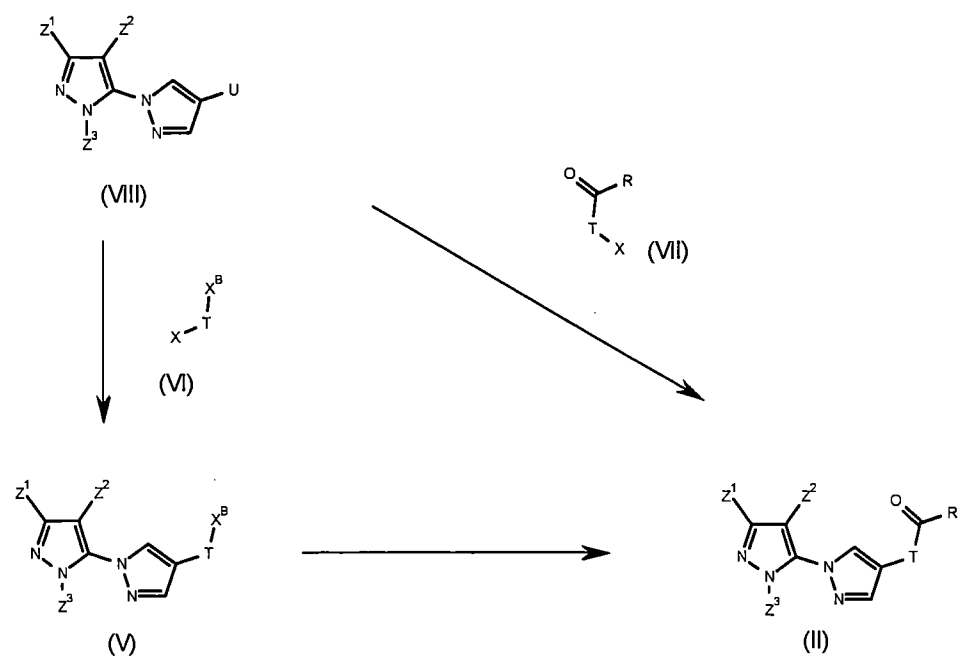
2) 具有式 (II) 之酸鹵化物 (其中 R 為 Cl、F 或 Br) 可在從熟習該項技術者已知的標準條件下從具有式 (II) 之羧酸 (其中 R 為 OH) 製造。

3) 具有式 (II) 之羧酸 (其中 R 為 OH) 可在從熟習該項技術者已知的標準條件下從具有式 (II) 之酯 (其中 R 為 C_1 - C_6 烷氧基) 形成。

4) 具有式 (Ia) 之化合物可以藉由在催化劑的存在下，例如鈹乙酸 (II) 或雙(三苯膦)鈹 (II) 二氯化物，視情況在配位基的存在下，例如三苯膦，以及鹼，例如碳酸鈉、吡啶、三乙胺、4-(二甲胺基)-吡啶 (“DMAP”) 或二異丙基乙基胺 (胡寧氏鹼)，在溶劑中，例如水、*N,N*-二甲基甲醯胺或四氫呋喃中，將具有式 (V) 之化合物 (其中 X^B 係離去基團，例如鹵素 (例如溴))

與一氧化碳和具有式 (IV) 之胺進行反應來製備。該反應係在從 50°C 至 200°C，較佳的是從 100°C 至 150°C 的溫度下進行。該反應係在從 50 巴至 200 巴，較佳的是從 100 巴至 150 巴的壓力下進行。

流程 2：



其中 Z¹、Z²、Z³和 T 係如在實施方式 1 至 69 中任一項定義的。

6) 具有式 (II) 之化合物(其中 R 係 OH)可以藉由在催化劑的存在下，例如乙酸鈣 (II) 或雙(三苯基膦)二氯化鈣 (II)，視情況在配位基的存在下，例如三苯基膦，二苯基膦二茂鐵 (“dppf”) 以及鹼，例如碳酸鈉、吡啶、三乙胺、4-(二甲基胺基)-吡啶 (“DMAP”) 或二異丙基-乙胺(胡寧氏鹼)，在溶劑中，例如水、N,N-二甲基甲醯胺或甲基四氫呋喃或四氫呋喃中，使具有式 (V) 之化合物(其中 X^B 係離去基團，例如三氟甲磺酸酯或鹵素(例如溴))與一氧化碳或甲酸鉀進行反應來製備。該反應係在從 50°C 至 200°C，較佳的是從 100°C 至 150°C 的溫度下進行。該反應係在從 50 巴至 200 巴，較佳的是從 100 巴至 150 巴的 CO 壓力下進行。

7) 具有式 (II) 之化合物 (其中 R 係 C_1-C_6 烷氧基) 可以藉由在催化劑的存在下, 例如乙酸鈮 (II) 或雙(三苯基膦)二氯化鈮 (II), 視情況在配位基的存在下, 例如三苯基膦, 以及鹼, 例如碳酸鈉、吡啶、三乙胺、4-(二甲基胺基)-吡啶 (“DMAP”) 或二異丙基-乙胺 (胡寧氏鹼), 在溶劑中, 例如水、*N,N*-二甲基甲醯胺或甲基四氫呋喃或四氫呋喃中, 使具有式 (V) 之化合物 (其中 X^B 係離去基團, 例如三氟甲磺酸酯或鹵素 (例如溴)) 與一氧化碳和醇進行反應來製備。該反應係在從 50°C 至 200°C , 較佳的是從 100°C 至 150°C 的溫度下進行。該反應係在從 50 巴至 200 巴, 較佳的是從 100 巴至 150 巴的一氧化碳壓力下進行。

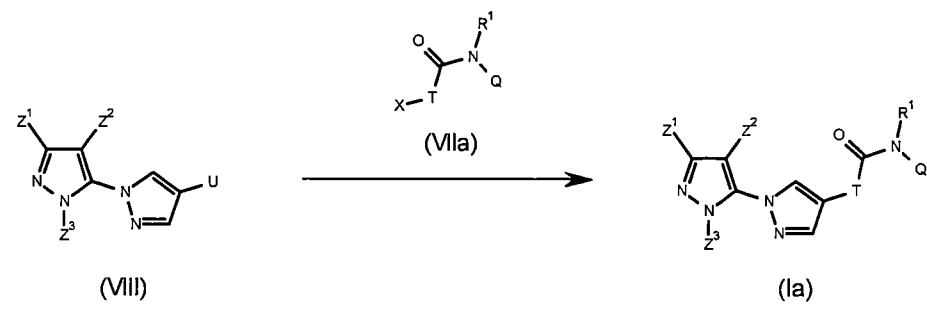
8) 可替代地, 具有式 (II) 之化合物 (其中 R 係 OH) 可以藉由使具有式 (V) 之化合物 (其中 X^B 係鹵素, 如溴) 與鎂或丁基鋰反應, 以製備中間體格氏 (Grignard) 試劑或對應地有機鋰試劑, 緊接著其與二氧化碳的反應, 在溶劑中, 如二乙醚、二異丙醚、三級丁基甲醚、甲基四氫呋喃或四氫呋喃中來製備。該反應係在從 -80°C 至 60°C , 較佳的是從 -20°C 至 40°C 的溫度下進行。中間體格氏試劑的製備 (鹵素 - 金屬反應) 也可以使用異丙基氯化鎂, 在存在或不存在鹼金屬鹽如氯化鋰的情況下進行。

9) 具有式 (II) 之化合物 (其中 R 係 OH 或 C_1-C_6 烷氧基) 可以藉由使具有式 (VIII) 之化合物 (其中 U 表示硼酸、硼酸酯或三氟硼酸酯或 -SnBu_3 或 -ZnCl) 與具有式 (VII) 之化合物 (其中 X 表示溴、氯、碘或三氟甲磺酸酯), 使用鈮催化的反應使用從文獻中已知的方法進行反應來製備。例如, 該反應可以在催化劑 (如乙酸鈮 (II)、鈮(0)四-三苯基膦或雙(三苯基膦)二氯化鈮(II)) 的存在下, 視情況在配位基 (如三苯基膦、二苯基膦二茂鐵

(“dppf”)) 和鹼 (如碳酸鈉、吡啶、三乙胺、4-(二甲基氨基)-吡啶 (“DMAP”) 或二異丙基乙胺 (胡寧氏鹼)) 的存在下，在溶劑 (如水、*N,N*-二甲基甲醯胺、甲基四氫呋喃或四氫呋喃) 中進行。該反應係在從 50°C 至 200°C，較佳的是從 100°C 至 150°C 的溫度下進行。該等具有通用結構 (VII) 之化合物係或者可商購的或可以藉由熟習該項技術者已知的方法，例如如在文獻 (WO 2014122083) 中描述的方法製備。

10) 具有式 (V) 之化合物 (其中 X^b 係離去基團，例如三氟甲磺酸酯或鹵素，如溴) 可以藉由使具有式 (VIII) 之化合物 (其中 U 表示硼酸、硼酸酯或三氟硼酸酯或-SnBu₃ 或-ZnCl) 與具有式 (VI) 之化合物 (其中 X 表示溴、氯、碘或三氟甲磺酸酯)，使用鈀催化的反應使用從文獻中已知的方法進行反應來製備。例如，該反應可以在催化劑 (如乙酸鈀 (II)、鈀(0)四-三苯基膦或雙(三苯基膦)二氯化鈀(II)) 的存在下，視情況在配位基 (如三苯基膦、二苯基膦二茂鐵 (“dppf”)) 和鹼 (如碳酸鈉、吡啶、三乙胺、4-(二甲基氨基)-吡啶 (“DMAP”) 或二異丙基-乙胺 (胡寧氏鹼)) 的存在下，在溶劑 (如水、*N,N*-二甲基甲醯胺、甲基四氫呋喃或四氫呋喃) 中進行。該反應係在從 50°C 至 200°C，較佳的是從 100°C 至 150°C 的溫度下進行。該等具有通用結構 (VI) 之化合物係或者可商購的或可以藉由熟習該項技術者已知的方法製備。該等具有通用結構 (VIII) 之化合物可以如在文獻 (WO 2014122083) 中描述的製備。

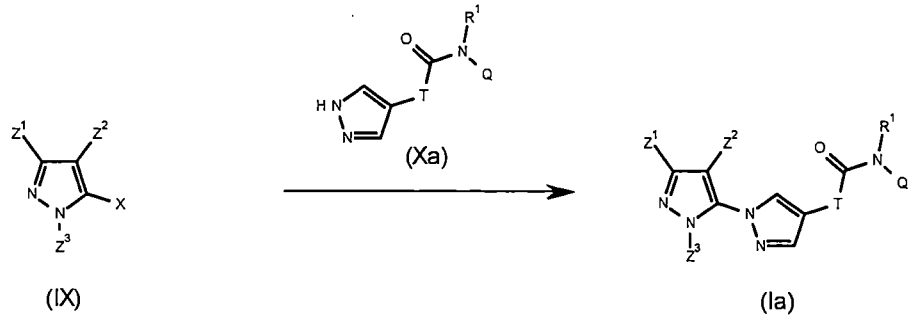
流程 3：



其中 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 R^1 、 Q 和 T 係如在實施方式 1 至 69 中任一項定義的。

11) 具有式 (Ia) 之化合物可以藉由使具有式 (VIII) 之化合物 (其中 U 表示硼酸、硼酸酯或三氟硼酸酯或-SnBu₃ 或-ZnCl) 與具有式 (VIIa) 之化合物 (其中 T 、 R^1 和 Q 係如在實施方式 1 至 69 中任一項定義的，其中 X 表示溴、氯、碘或三氟甲磺酸酯)，使用鈀催化的反應使用從文獻中已知的方法進行反應來製備，如在 9) 和 10) 中描述的。該等具有通用結構 (VIIa) 之化合物係或者可商購的或可以藉由熟習該項技術者已知的方法製備。該等具有通用結構 (VIII) 之化合物可以如在文獻 (WO 2014122083) 中描述的製備。

流程 4：



其中 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 R^1 、 Q 和 T 係如在實施方式 1 至 69 中任一項定義的。

12) 具有式 (Ia) 化合物的可以藉由使具有式 (IX) 之化合物 (其中 X 係鹵素) 與具有式 (Xa) 之化合物 (其中 T 、 R^1 和 Q 係如在實施方式 1 至

69 中任一項定義的), 使用從文獻中已知的方法, 或者藉由在芳環上的親核取代 ($X = \text{Cl}$ 或 F) (WO 2014122083), 或藉由過渡金屬催化反應 ($X = \text{Br}$ 或 I), 例如, 使用鈀或銅催化反應進行反應來製備。該等具有通用結構 (IX) 和 (Xa) 之化合物可以藉由熟習該項技術者已知的方法製備 (WO 2014122083)。

【0050】 根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物能以本身已知的方式藉由以常規方式將根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的起始化合物的一個或多個取代基用根據本發明的另一個或其他的取代基的替代轉化為根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的另一種化合物。

【0051】 取決於所選的適合各自情況的反應條件以及起始材料, 有可能例如, 在一個反應步驟中僅將一個取代基用根據本發明的另一個取代基替代, 或者在同一個反應步驟中可以將多個取代基用多個根據本發明的其他取代基來替代。

【0052】 具有式 (I) 之該等化合物的鹽可以以本身已知的方式進行製備。因此, 例如, 根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物的酸加成鹽係藉由用適合的酸或合適的離子交換試劑進行處理來獲得的, 並且與鹼的鹽係藉由用適合的鹼或用合適的離子交換試劑進行處理來獲得的。

【0053】 根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物的鹽能以常規方式轉化為游離的化合物、酸加成鹽 (例如藉由用合適的鹼性化合物或用合適的離子交換試劑進行處理) 以及與鹼的鹽 (例如藉由用合適的酸或用合適的離子交換試劑進行處理)。

【0054】 根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物的鹽能以本身

已知的方式轉化為根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物的其他鹽、酸加成鹽，例如轉變成為其他酸加成鹽，例如藉由在合適的溶劑中用酸的合適的金屬鹽（比如鈉、鋇或銀鹽，例如用乙酸銀）來處理無機酸的鹽（比如鹽酸鹽），在該溶劑中，所形成的無機鹽（例如氯化銀）係不溶的並且因此從該反應混合物中沈澱出。

【0055】 取決於該程序或反應條件，具有成鹽特性的根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物能以游離形式或鹽的形式獲得。

【0056】 根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物和適當時其互變異構物（在每種情況下呈游離形式或呈鹽形式）能夠以可能的立體異構物之一的形式或以該等異構物的混合物的形式，例如以純立體異構物（例如鏡像物和/或非鏡像異構物）形式或以立體異構物混合物（例如鏡像異構物混合物，例如外消旋體；非鏡像異構物混合物或外消旋體混合物）形式存在，取決於分子中存在的不對稱碳原子的數目、絕對和相對組態和/或取決於分子中存在的非芳香族雙鍵的組態；本發明涉及純立體異構物以及可能的所有立體異構物混合物，並且在上下文的每種情況下，甚至在沒有具體提及立體化學細節的每種情況下，都應該從這層意義上來理解。

【0057】 處於游離形式或鹽形式的根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物的非鏡像異構物混合物或外消旋體的混合物（它們的獲得可以取決於已選定的起始材料和程序）能夠在該等組分的物理化學差異的基礎上，例如藉由分步結晶、蒸餾和/或層析法用已知的方法分離成純的非鏡像異構物或外消旋體。

【0058】 能夠以類似方式獲得的鏡像異構物混合物（例如外消旋體）

可以藉由已知方法拆分成光學鏡像物，例如藉由從光學活性溶劑再結晶；藉由在手性吸附劑上的層析法，例如在乙醯纖維素上的高效液相層析法（HPLC）；借助於合適的微生物，藉由用特異性固定化酶裂解；藉由形成包含化合物，例如使用手性冠醚，其中僅一個鏡像異構物被錯合；或藉由轉化成非鏡像異構鹽，例如藉由使鹼性最終產物外消旋體與光學活性酸（例如羧酸，例如樟腦酸、酒石酸或蘋果酸或磺酸，例如樟腦磺酸）反應，並且分離能夠以此方式獲得的非鏡像異構物混合物，例如基於其不同溶解度藉由分步結晶，從而獲得非鏡像異構物，從該等非鏡像異構物可以藉由合適的試劑（例如鹼性試劑）的作用使所希望的鏡像異構物變成游離。

【0059】 純的非鏡像異構物或鏡像異構物能根據本發明來獲得，不僅是藉由分離合適的立體異構物混合物，還可以是藉由普遍已知的非鏡像立體選擇性或鏡像選擇性合成的方法，例如藉由根據本發明利用合適的立體化學的起始材料進行該方法。

【0060】 可以藉由使根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物與適合的氧化劑（例如 H_2O_2 /脛加合物）在酸酐（例如，三氟乙酸酐）存在下進行反應製備 N-氧化物。此類氧化從文獻，例如，從藥物化學雜誌（J. Med. Chem.）32 (12)，2561-73，1989 或 WO 00/15615 中已知。

【0061】 有利的是在每一情況中分離或合成生物學地更有效的立體異構物，例如鏡像異構物或非鏡像異構物或立體異構物混合物，例如鏡像異構物混合物或非鏡像異構物混合物，如果個別組分具有不同的生物活性。

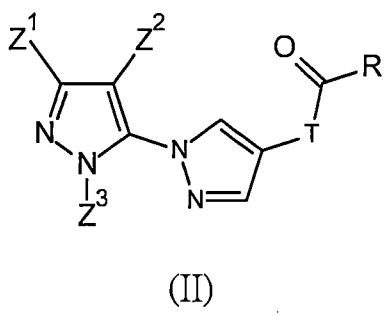
【0062】 根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物以及適當時其互變異構物（在每種情況下處於游離形式或鹽形式）如果適當的話還能以

水合物的形式獲得和/或包括其他的溶劑，例如可以用於以固體形式存在的化合物的結晶的那些。

【0063】 本發明的化合物與已知的化合物的區別可以在於在低施用率下更大的療效，這可以由熟習該項技術者使用在實例中概述的實驗程序，使用更低的施用率（如果必要的話）例如，50 ppm、12.5 ppm、6 ppm、3 ppm、1.5 ppm 或 0.8 ppm 來證實。

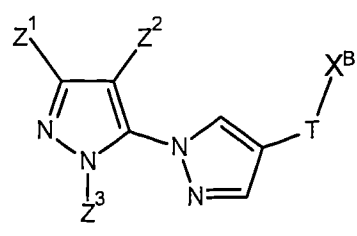
【0064】 本發明還提供了有用於製備根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物的中間體。某些中間體係新穎的並且如此形成本發明的另一個方面。

【0065】 一組新穎中間體係具有式 (II) 之化合物



其中 T、Z¹、Z²和 Z³係如實施方式 1 至 69 中任一項定義的，並且 R 係選自 OH、C₁-C₆烷氧基、Cl、F 和 Br。較佳的項 T、Z¹、Z²和 Z³係與對於根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物的對應取代基所列出的較佳的項相同的。

【0066】 另一組新穎中間體係具有式 (III) 之化合物



(III)

其中 T、Z¹、Z²和 Z³係如實施方式 1 至 69 中任一項定義的，並且 X^B係適合的離去如鹵素，例如 Br。對於 T、Z¹、Z²和 Z³的較佳的項係與對於根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物的對應取代基所列出的較佳的項相同的。

【0067】 根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物在害蟲控制領域中是有預防和/或治療價值的活性成分，即使係在低的施用量下，它們具有非常有利的殺生物譜並且係溫血物種、魚以及植物良好耐受的。根據本發明的該等活性成分作用於正常敏感的以及還有抗藥的動物有害生物（如昆蟲或蜱蟎目的代表）的所有的或個別的發育階段。根據本發明的活性成分的殺昆蟲或殺蟎活性可以本身直接顯示，亦即或者立即或者僅在過去一些時間之後（例如在蛻皮期間）發生破壞有害生物；或間接顯示，例如降低產卵和/或孵化率。

【0068】 上述動物有害生物的實例係：

來自蜱蟎目，例如，

下毛癭蟎屬（*Acalitus* spp.）、針刺癭蟎屬（*Aculus* spp.）、窄癭蟎屬（*Acaricalus* spp.）、瘤癭蟎屬（*Aceria* spp.）、粗腳粉蟎（*Acarus siro*）、鈍眼蜱屬（*Amblyomma* spp.）、銳緣蜱屬（*Argas* spp.）、牛蜱屬（*Boophilus* spp.）、短須蟎屬（*Brevipalpus* spp.）、苔蟎屬（*Bryobia* spp.）、上三節癭蟎屬（*Calipitrimerus* spp.）、皮蟎屬（*Chorioptes* spp.）、雞皮刺蟎（*Dermanyssus gallinae*）、表皮蟎屬（*Dermatophagoides* spp.）、始葉蟎屬（*Eotetranychus* spp.）、癭蟎屬（*Eriophyes* spp.）、半跗線蟎屬（*Hemitarsonemus* spp.）、璃眼蜱屬

(*Hyalomma* spp.)、硬蜱屬 (*Ixodes* spp.)、小爪蟎屬 (*Olygonychus* spp.)、鈍緣蜱屬 (*Ornithodoros* spp.)、側多食跗線蟎 (*Polyphagotarsonus latus*)、全爪蟎屬 (*Panonychus* spp.)、桔藝鏽蟎 (*Phyllocoptura oleivora*)、植食蟎 (*Phytonemus* spp.)、跗線蟎屬 (*Polyphagotarsonemus* spp.)、癢蟎屬 (*Psoroptes* spp.)、扇頭蜱屬 (*Rhipicephalus* spp.)、根嗜蟎屬 (*Rhizoglyphus* spp.)、疥蟎屬 (*Sarcoptes* spp.)、狹跗線蟎屬 (*Steneotarsonemus* spp.)、跗線屬 (*Tarsonemus* spp.) 以及葉蟎屬 (*Tetranychus* spp.)；

來自虱目，例如，

血虱屬 (*Haematopinus* spp.)、長顎虱屬 (*Linognathus* spp.)、人虱屬 (*Pediculus* spp.)、天庖瘡屬 (*Pemphigus* spp.) 以及木虱屬 (*Phylloxera* spp.)；

來自鞘翅目，例如，

缺隆叩甲屬 (*Agriotes* spp.)、*Amphimallonmajale*、東方異麗金龜 (*Anomala orientalis*)、花象屬 (*Anthonomus* spp.)、蜉金龜屬 (*Aphodius* spp.)、*Astylus atromaculatus*、*Ataenius* spp、*Atomaria linearis*、甜菜脛跳甲 (*Chaetocnema tibialis*)、螢葉甲屬 (*Cerotoma* spp)、單葉叩甲屬 (*Conoderus* spp)、根頸象屬 (*Cosmopolites* spp.)、綠金龜 (*Cotinisnitida*)、象蟲屬 (*Curculio* spp.)、圓頭犀金龜屬 (*Cyclocephala* spp)、圓頭犀金龜屬 (*Dermestes* spp.)、根螢葉甲屬 (*Diabrotica* spp.)、*Diloboderus abderus*、食植瓢蟲屬 (*Epilachna* spp.)、*Eremnus* spp.、黑異爪蔗金龜 (*Heteronychus arator*)、咖啡果小蠹 (*Hypothenemus hampei*)、*Lagria vilosa*、馬鈴薯甲蟲 (*Leptinotarsa decemLineata*)、稻水象屬 (*Lissorhoptrus* spp.)、*Liogenys* spp、*Maecolaspis* spp、栗色絨金龜 (*Maladera castanea*)、*Megascelis* spp、*Melighetes aeneus*、金龜屬 (*Melolontha* spp.)、

Myochrous armatus、鋸穀盜屬 (*Oryzaephilus* spp.)、耳喙象屬 (*Otiorhynchus* spp.)、鯢角金龜屬 (*Phyllophaga* spp.)、斑象屬 (*Phlyctinus* spp.)、麗金龜屬 (*Popillia* spp.)、油菜跳甲屬 (*Psylliodes* spp.)、*Rhyssomatus aubtilis*、劫根蠹屬 (*Rhizopertha* spp.)、金龜子科 (*Scarabeidae*)、米象屬 (*Sitophilus* spp.)、麥蛾屬 (*Sitotroga* spp.)、偽切根蟲屬 (*Somaticus* spp.)、*Sphenophorus* spp、大豆莖象 (*Sternechus subsignatus*)、擬步行蟲屬 (*Tenebrio* spp.)、擬穀盜屬 (*Tribolium* spp.) 以及斑皮蠹屬 (*Trogoderma* spp.)；

來自雙翅目，例如，

伊蚊屬 (*Aedes* spp.)、瘧蚊屬 (*Anopheles* spp.)、高粱芒蠅 (*Antherigona soccata.*)、橄欖果實蠅 (*Bactrocea oleae*)、花園毛蚊 (*Bibio hortulanus*)、遲眼蕈蚊屬 (*Bradysia* spp.)、紅頭麗蠅 (*Calliphora erythrocephala*)、小條實蠅屬 (*Ceratitis* spp.)、金蠅屬 (*Chrysomyia* spp.)、庫蚊屬 (*Culex* spp.)、黃蠅屬 (*Cuterebra* spp.)、寡鬚實蠅屬 (*Dacus* spp.)、地種蠅屬 (*Delia* spp.)、黑腹果蠅 (*Drosophilamelanogaster*)、廁蠅屬 (*Fannia* spp.)、胃蠅屬 (*Gastrophilus* spp.)、*Geomyza tripunctata*、舌蠅屬 (*Glossina* spp.)、皮蠅屬 (*Hypoderma* spp.)、虱蠅屬 (*Hyppobosca* spp.)、斑潛蠅屬 (*Liriomyza* spp.)、綠蠅屬 (*Lucilia* spp.)、潛蠅屬 (*Melanagromyza* spp.)、家蠅屬 (*Musca* spp.)、狂蠅屬 (*Oestrus* spp.)、癭蚊屬 (*Orseolia* spp.)、瑞典麥稈蠅 (*Oscinella frit*)、藜泉蠅 (*Pegomyia hyoscyami*)、草種蠅屬 (*Phorbia* spp.)、繞實蠅屬 (*Rhagoletis* spp.)、*Rivelia quadrifasciata*、*Scatella* 屬、蕈蚊屬 (*Sciara* spp.)、刺蠅屬 (*Stomoxys* spp.)、虻屬 (*Tabanus* spp.)、條蟲屬 (*Tannia* spp.) 以及大蚊屬 (*Tipula* spp.)；

來自半翅目，例如，

瘤緣蝽 (*Acanthocoris scabrator*)、綠蝽屬、苜蓿盲蝽、*Amblypeltanitia*、海蝦盾緣蝽 (*Bathypoelia thalassina*)、土長蝽屬、臭蟲屬、*Clavigralla tomentosicollis*、盲蝽屬 (*Creontiades* spp.)、可可瘤盲蝽、*Dichelops furcatus*、棉紅蝽屬、*Edessa* 屬、美洲蝽屬 (*Euchistus* spp.)、六斑菜蝽 (*Eurydema pulchrum*)、扁盾蝽屬、茶翅蝽、具凹巨股長蝽 (*Horciasnobilellus*)、稻緣蝽屬、草盲蝽屬、熱帶碩蚧屬、捲心菜斑色蝽 (*Murgantia histrionic*)、*Neomegalotomus* 屬、煙盲蝽 (*Nesidiocoris tenuis*)、綠蝽屬、擬長蝽 (*Nysius simulans*)、*Oebalus insularis*、皮蝽屬、壁蝽屬、紅獵蝽屬、可可盲蝽象、*Scaptocoris castanea*、黑蝽屬 (*Scotinophara* spp.)、*Thyanta* 屬、錐鼻蟲屬、木薯網蝽 (*Vatiga illudens*)；

無網長管蚧屬、*Adalges* spp、*Agalliana ensigera*、塔爾吉奧尼木虱 (*Agonosceua targionii*)、粉虱屬 (*Aleurodicus* spp.)、刺粉虱屬 (*Aleurocanthus* spp)、甘蔗穴粉虱、軟毛粉虱 (*Aleurothrixus floccosus*)、甘藍粉虱 (*Aleyrodes brassicae*)、棉葉蟬 (*Amarasca biguttula*)、椶果長突葉蟬 (*Amritodus atkinson*)、腎圓盾蚧屬、蚧科、蚧屬、蚧屬 (*Aspidiotus* spp.)、茄溝無網蚧、馬鈴薯木虱 (*Bactericera cockerelli*)、小粉虱屬、短尾蚧屬 (*Brachycaudus* spp)、甘藍蚧、喀木虱屬、雙尾蚧 (*Cavariella aegopodii* Scop.)、蠟蚧屬 (*Ceroplaster* spp)、褐圓蚧 (*Chrysomphalus aonidium*)、網籽草葉圓蚧 (*Chrysomphalus dictyospermi*)、大葉蟬屬 (*Cicadella* spp)、大白葉蟬 (*Cofana spectra*)、隱瘤蚧屬、葉蟬屬 (*Cicadulina* spp)、褐軟蚧 (*Coccus hesperidum*)、玉米黃翅葉蟬 (*Dalbulus maidis*)、裸粉虱屬 (*Dialeurodes* spp)、柑橘木虱 (*Diaphorina citri*)、麥雙尾蚧 (*Diuraphis noxia*)、西圓尾蚧屬 (*Dysaphis* spp)、小綠葉蟬屬

(*Empoasca* spp.)、蘋果綿蚜(*Eriosoma larigerum*)、葡萄斑葉蟬屬(*Erythroneura* spp.)、蠟蛤屬(*Gascardia* spp.)、赤桉木虱(*Glycaspis brimblecombei*)、菜縊管蚜、大尾蚜屬(*Hyalopterus* spp.)、超瘤蚜種、檬果綠葉蟬(*Idioscopus clypealis*)、非洲葉蟬(*Jacobiasca lybica*)、灰飛虱屬(*Laodelphax* spp.)、球堅蚧(*Lecanium corni*)、蠟盾蚧屬(*Lepidosaphes* spp.)、蘿蔔蚜(*Lopaphis erysimi*)、*Lyogenys maidis*、長管蚜屬、沫蟬屬(*Mahanarva* spp.)、蛾蠟蟬科(*Metcalfa pruinosa*)、麥無網蚜、*Myndus crudus*、瘤蚜屬(*Myzus* spp.)、臺灣韭蚜(*Neotoxoptera* sp.)、黑尾葉蟬屬(*Nephotettix* spp.)、褐飛虱屬(*Nilaparvata* spp.)、梨大綠蚜、狗牙根草芥殼蟲(*Odonaspis ruthae*)、寄生甘蔗綿蚜(*Oregma lanigera* Zehnter)、楊梅緣粉虱(*Parabemisia myricae*)、考氏木虱(*Paratrioza cockerelli*)、片盾蚧屬(*Parlatoria* spp.)、癭綿蚜屬(*Pemphigus* spp.)、玉米蠟蟬(*Peregrinus maidis*)、扁角飛虱屬(*Perkinsiella* spp.)、忽布疣蚜(*Phorodon humuli*)、根瘤蚜屬(*Phylloxera* spp.)、動性-球菌屬(*Planococcus* spp.)、白盾蚧屬(*Pseudaulacaspis* spp.)、粉蚧屬(*Pseudococcus* spp.)、棉盲蝽(*Pseudatomoscelis seriatus*)、木虱屬、棉蚧(*Pulvinaria aethiopica*)、笠圓盾蚧屬、*Quesada gigas*、電光葉蟬(*Recilia dorsalis*)、縊管蚜屬(*Rhopalosiphum* spp.)、黑盔蚧屬(*Saissetia* spp.)、帶葉蟬屬(*Scaphoideus* spp.)、二叉蚜屬(*Schizaphis* spp.)、麥蚜屬(*Sitobion* spp.)、白背飛虱、三角苜蓿跳蟲(*Spissistilus festinus*)、條斑飛虱(*Tarophagus Proserpina*)、聲蚜屬、粉虱屬、*Tridiscus sporoboli*、葵粉蚧屬(*Trionymus* spp.)、非洲木虱、桔矢尖蚧、火焰斑葉蟬(*Zygina flammigera*)、*Zyginidia scutellaris*；

來自膜翅目，例如，

頂切葉蟻屬(*Acromyrmex*)、三節葉蜂屬(*Arge* spp.)、布切葉白蟻屬(*Atta* spp.)、莖葉蜂屬(*Cephus* spp.)、松葉蜂屬(*Diprion* spp.)、鋸角葉蜂科(*Diprionidae*)、松葉蜂(*Gilpinia polytoma*)、梨實蜂屬(*Hoplocampa* spp.)、毛蟻屬(*Lasius* spp.)、小黃家蟻(*Monomorium pharaonis*)、新松葉蜂屬(*Neodiprion* spp.)、農蟻屬(*Pogonomyrmex* spp.)、*Slenopsis invicta*、水蟻屬(*Solenopsis* spp.)以及胡蜂屬(*Vespa* spp.)；

來自等翅目，例如，

家白蟻屬(*Coptotermes* spp.)、白蟻(*Cornitermes cumulans*)、楹白蟻屬(*Incisitermes* spp.)、大白蟻屬(*Macrotermes* spp.)、澳白蟻屬(*Mastotermes* spp.)、小白蟻屬(*Microtermes* spp.)、散白蟻屬(*Reticulitermes* spp.)、熱帶火蟻(*Solenopsis geminate*)

來自鱗翅目，例如，

長翅卷蛾屬(*Acleris* spp.)、褐帶卷蛾屬(*Adoxophyes* spp.)、透翅蛾屬(*Aegeria* spp.)、地夜蛾屬(*Agrotis* spp.)、棉葉蟲(*Alabama argillaceae*)、*Amylois* 屬(*Amylois* spp.)、黎豆夜蛾(*Anticarsia gemmatalis*)、黃卷蛾屬(*Archips* spp.)、銀蛾屬(*Argyresthia* spp.)(*Argyresthia* spp.)、帶卷蛾屬(*Argyrotaenia* spp.)、丫紋夜蛾屬(*Autographa* spp.)、棉潛蛾(*Bucculatrix thurberiella*)、玉米楷夜蛾(*Busseola fusca*)、粉斑螟蛾(*Cadra cautella*)、桃蛀果蛾(*Carposina nipponensis*)、禾草螟屬(*Chilo* spp.)、卷葉蛾屬(*Choristoneura* spp.)、越蔓桔草螟(*Chrysoteuchia topiaria*)、葡萄果蠹蛾(*Clysia ambi-guella*)、卷葉螟屬(*Cnaphalocrocis* spp.)、雲卷蛾屬(*Cnephasia* spp.)、紋卷蛾屬(*Cochylis* spp.)、鞘蛾屬(*Coleophora* spp.)、磷翅目粉蝶(*Colias lesbia*)、*Cosmophila flava*

(*Cosmophila flava*)、草螟屬(*Crambus* spp.)、大菜螟(*Crocidolomia binotalis*)、蘋果異形小卷蛾(*Cryptophlebia leucotreta*)、黃楊木蛾(*Cydalima perspectalis*)、小卷蛾屬(*Cydia* spp.)、黃楊絹野螟(*Diaphania perspectalis*)、杆草螟屬(*Diatraea* spp.)、蘇丹棉鈴蟲(*Diparopsis castanea*)、金剛鑽屬(*Earias* spp.)、非洲莖螟(*Eldana saccharina*)、粉螟屬(*Ephestia* spp.)、葉小卷蛾屬(*Epinotia* spp.)、細斑燈蛾(*Estigmene acrea*)、*Etiella zinckinella* (*Etiella zinckinella*)、花小卷蛾屬(*Eucosma* spp.)、環針單紋蛾(*Eupoecilia ambiguella*)、黃毒蛾屬(*Euproctis* spp.)、切根蟲屬(*Euxoa* spp.)、*Feltia jaculiferia*、*Grapholita* 屬(*Grapholita* spp.)、綠青蟲蛾(*Hedya nubiferana*)、實夜蛾屬(*Heliothis* spp.)、菜螟(*Hellula undalis*)、切葉野螟屬(*Herpetogramma* spp.)、美國白蛾(*Hyphantria cunea*)、番茄蠹蛾(*Keiferia lycopersicella*)、*Lasmopalpus lignosellus*、旋紋潛葉蛾(*Leucoptera scitella*)、潛葉細蛾屬(*Lithocollethis* spp.)、葡萄花翅小卷蛾(*Lobesia botrana*)、*Loxostege bifidalis*、毒蛾屬(*Lymantria* spp.)、潛蛾屬(*Ly-onetia* spp.)、幕枯葉蛾屬(*Malacosoma* spp.)、甘藍夜蛾(*Mamestra brassicae*)、煙草天蛾(*Manduca sexta*)、*Mythimna* 屬(*Mythimna* spp.)、夜蛾屬(*Noctua* spp.)、秋尺蛾屬(*Operophtera* spp.)、*Orniodes indica* (*Orniodes indica*)、歐洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis*)、超小卷蛾屬(*Pammene* spp.)、褐卷蛾屬(*Pandemis* spp.)、小眼夜蛾(*Panolis flammea*)、蛀莖夜蛾(*Papaipema nebris*)、*Pectinophora gossypi-ela*、咖啡潛葉蛾(*Perileucoptera coffeella*)、一星黏蟲(*Pseudaletia unipuncta*)、馬鈴薯麥蛾(*Phthorimaea operculella*)、菜粉蝶(*Pieris rapae*)、粉蝶屬(*Pieris* spp.)、小菜蛾(*Plutella xylostella*)、芽蛾屬(*Prays* spp.)、尺葉蛾屬(*Pseudoplusia* spp.)、薄荷灰夜蛾(*Rachiplusia nu*)、西方豆地香(*Richia*

albicosta)(*Richia albicosta*)、白禾螟屬(*Scir-pophaga spp.*)、蛀莖夜蛾屬(*Sesamia spp.*)、長須卷蛾屬(*Sparganothis spp.*)、灰翅夜蛾屬(*Spodoptera spp.*)、棉大卷葉螟(*Sylepta derogate*)、興透翅蛾屬(*Synanthedon spp.*)、異舟蛾屬(*Thaumetopoea spp.*)、卷葉蛾屬(*Tortrix spp.*)、粉紋夜蛾(*Trichoplusia ni*)、番茄斑潛蠅(*Tuta absoluta*)、以及巢蛾屬(*and Yponomeuta spp.*)；

來自食毛目，例如，

畜虱屬和鬚毛虱屬；

來自直翅目，例如，

蠊屬(*Blatta spp*)、小蠊屬(*Blattella spp.*)、螻蛄屬(*Gryllotalpa spp.*)、馬德拉蜚蠊(*Leucophaea maderae*)、飛蝗屬(*Locusta spp.*)、北痣蟋蟀(*Neocurtilla hexadactyla*)、大蠊屬、痣蟋蟀屬(*Scapteriscus spp*)、以及沙漠蝗屬；

來自齧蟲目，例如，

虱齧屬(*Liposcelis spp*)；

來自蚤目，例如，

角葉蚤屬、櫛頭蚤屬和印鼠客蚤；

來自繆翅目，例如，

Calliothrips phaseoli、花薊馬屬(*Frankliniella spp.*)、陽薊馬屬(*Heliothrips spp*)、褐帶薊馬屬(*Hercinothrips spp.*)、單親薊馬屬(*Parthenothrips spp.*)、橙花替硬薊馬(*Scirtothrips aurantii*)、豆薊馬(*Sericothrips variabilis*)、帶薊馬屬、薊馬屬；

來自繆尾目，例如，衣魚(*Lepisma saccharina*)。

【0069】 根據本發明的活性成分可用於控制、也就是遏制或破壞上述類型的有害生物，該等有害生物特別出現在植物上，尤其是在農業中、在園藝中以及在林業中的有用的植物和觀賞植物上，或者在該等植物的器官上，例如果實、花、葉、莖、塊莖或根，並且在一些情況下，甚至在隨後的時間點形成的植物器官仍保持受保護抵抗該等有害生物。

【0070】 適合的目標作物具體係穀物，例如小麥、大麥、黑麥、燕麥、水稻、玉米或高粱；甜菜，例如糖或飼料甜菜；水果，例如梨果類水果、核果類水果或無核水果，例如蘋果、梨、李子、桃、杏仁、櫻桃或漿果，例如草莓、覆盆子或黑莓；豆科作物，例如蠶豆、小扁豆、豌豆或大豆；油料作物，例如油菜、芥菜、罌粟、橄欖、向日葵、椰子、蓖麻、可可或花生；葫蘆，例如南瓜、黃瓜或甜瓜；纖維植物，例如棉花、亞麻、大麻或黃麻；柑桔類水果，例如柳橙、檸檬、葡萄柚或橘子；蔬菜，例如菠菜、萵苣、蘆筍、甘藍、胡蘿蔔、洋蔥、蕃茄、馬鈴薯或鈴狀椒；樟科植物，例如鱧梨、肉桂或樟腦；以及還有菸草、堅果、咖啡、茄子、甘蔗、茶葉、胡椒、葡萄樹、蛇麻子、車前科、產膠植物以及觀賞植物。

【0071】 根據本發明的該等活性成分尤其適合於控制棉花、蔬菜、玉米、水稻以及大豆作物上的扁豆蚜、黃瓜條葉甲、煙芽夜蛾、桃蚜、小菜蛾以及海灰翅夜蛾。根據本發明的該等活性成分另外尤其適合於控制甘藍夜蛾（較佳的是在蔬菜上）、蘋果蠹蛾（較佳的是在蘋果上）、小綠葉蟬（較佳的是在蔬菜、葡萄園裡）、馬鈴薯葉甲（較佳的是在馬鈴薯上）以及二化螟（較佳的是在水稻上）。

【0072】 在另一個方面，本發明還可涉及控制由植物寄生的線蟲（內

寄生的-、半內寄生的-以及外寄生的線蟲)對植物或其部分引起損害的一種方法，尤其是以下植物寄生的線蟲，如根結線蟲 (root knot nematodes)、北方根結線蟲 (*Meloidogyne hapla*)、南方根結線蟲 (*Meloidogyne incognita*)、爪哇根結線蟲 (*Meloidogyne javanica*)、花生根結線蟲 (*Meloidogyne arenaria*) 以及其他根結線蟲屬種類 (*Meloidogyne species*)；孢囊形成線蟲 (cyst-forming nematodes)、馬鈴薯金線蟲 (*Globodera rostochiensis*) 以及其他球孢囊線蟲屬種類 (*Globodera species*)；禾穀孢囊線蟲 (*Heterodera avenae*)、大豆孢囊線蟲 (*Heterodera glycines*)、甜菜孢囊線蟲 (*Heterodera schachtii*)、紅三葉異皮線蟲 (*Heterodera trifolii*)、以及其他異皮線蟲屬種類 (*Heterodera species*)；種癭線蟲 (Seed gall nematodes)、粒線蟲屬種類 (*Anguina species*)；莖及葉面線蟲 (Stem and foliar nematodes)、滑刃線蟲屬種類 (*Aphelenchoides species*)；刺毛線蟲 (Sting nematodes)、長尾刺線蟲 (*Belonolaimus longicaudatus*) 以及其他刺線蟲屬種類；松樹線蟲 (Pine nematodes)、松材線蟲 (*Bursaphelenchus xylophilus*) 以及其他傘滑刃屬種類 (*Bursaphelenchus species*)；環形線蟲 (Ring nematodes)、環線蟲屬種類 (*Criconema species*)、小環線蟲屬種類 (*Criconemella species*)、輪線蟲屬種類 (*Criconemoides species*)、中環線蟲屬種類 (*Mesocriconema species*)；莖及鱗球莖線蟲 (Stem and bulb nematodes)、腐爛莖線蟲 (*Ditylenchus destructor*)、鱗球莖莖線蟲 (*Ditylenchus dipsaci*) 以及其他莖線蟲屬種類 (*Ditylenchus species*)；錐線蟲 (Awl nematodes)、錐線蟲屬種類 (*Dolichodorus species*)；螺旋線蟲 (Spiral nematodes)、多頭螺旋線蟲 (*Helicotylenchus multicinctus*) 以及其他螺旋線蟲屬種類 (*Helicotylenchus species*)；鞘及鞘形線蟲 (Sheath and sheathoid

nematodes)、鞘線蟲屬種類 (*Hemicycliophora* species) 以及半輪線蟲屬種類 (*Hemicriconemoides* species); 潛根線蟲屬種類 (*Hirshmanniella* species); 支線蟲 (Lance nematodes)、冠線蟲屬種類 (*Hoploaimus* species); 假根結線蟲 (false rootknot nematodes)、珍珠線蟲屬種類 (*Nacobbus* species); 針狀線蟲 (Needle nematodes)、橫帶長針線蟲 (*Longidorus elongatus*) 以及其他長針線蟲屬種類 (*Longidorus* species); 大頭針線蟲 (Pin nematodes)、短體線蟲屬種類 (*Pratylenchus* species); 腐線蟲 (Lesion nematodes)、花斑短體線蟲 (*Pratylenchus neglectus*)、穿刺短體線蟲 (*Pratylenchus penetrans*)、彎曲短體線蟲 (*Pratylenchus curvatus*)、古氏短體線蟲 (*Pratylenchus goodeyi*) 以及其他短體線蟲屬種類 (*Pratylenchus* species); 柑桔穿孔線蟲 (Burrowing nematodes)、香蕉穿孔線蟲 (*Radopholus similis*) 以及其他內侵線蟲屬種類 (*Radopholus* species); 腎形線蟲 (Reniform nematodes)、羅柏氏盤旋線蟲 (*Rotylenchus robustus*)、腎形盤旋線蟲 (*Rotylenchus reniformis*) 以及其他盤旋線蟲屬種類 (*Rotylenchus* species); 盾線蟲屬種類 (*Scutellonema* species); 短粗根線蟲 (Stubby root nematodes)、原始毛刺線蟲 (*Trichodorus primitivus*) 以及其他毛刺線蟲屬種類 (*Trichodorus* species)、擬毛刺線蟲屬種類 (*Paratrichodorus* species); 矮化線蟲 (Stunt nematodes)、馬齒莧矮化線蟲 (*Tylenchorhynchus claytoni*)、順逆矮化線蟲 (*Tylenchorhynchus dubius*) 以及其他矮化線蟲屬種類 (*Tylenchorhynchus* species); 柑桔線蟲 (Citrus nematodes)、穿刺線蟲屬種類 (*Tylenchulus* species); 短劍線蟲 (Dagger nematodes)、劍線蟲屬種類 (*Xiphinema* species); 以及其他植物寄生的線蟲種類, 如亞粒線蟲屬 (*Subanguina* spp.)、Hypsoperine 屬、大刺環線蟲屬

(*Macroposthonia* spp.)、*Melinius* 屬、刻點胞囊屬 (*Punctodera* spp.)、以及五溝線蟲屬 (*Quinisulcius* spp.)。

【0073】 根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物還可以具有抵抗軟體動物的活性。該等軟體動物的實例包括，例如蘋果螺科；阿勇蛞蝓屬 (*Arion*) (灰黑阿勇蛞蝓 (*A. ater*)、環斑阿勇蛞蝓 (*A. circumscriptus*)、庭院阿勇蛞蝓 (*A. hortensis*)、紅棕阿勇蛞蝓 (*A. rufus*))；巴蝸牛科 (灌木巴蝸牛 (*Bradybaena fruticum*))；蝸牛屬 (庭院蝸牛 (*C. hortensis*)，森林蝸牛 (*C. nemoralis*))；*ochlodina*；灰蛞蝓屬 (*Deroceras*) (野灰蛞蝓 (*D. agrestis*)、*D. empiricorum*、田灰蛞蝓 (*D. laeve*)、庭園灰蛞蝓 (*D. reticulatum*))；圓盤螺屬 (*Discus*) (*D. rotundatus*)；*Euomphalia*；土蝸屬 (*Galba*) (截形土蝸 (*G. trunculata*))；小蝸牛屬 (*Helicelia*) (伊塔拉小蝸牛 (*H. itala*)、布維小蝸牛 (*H. obvia*))；大蝸牛科 *Helicigona arbustorum*)；*Helicodiscus*；大蝸牛屬 (*Helix*) (開放大蝸牛 (*H. aperta*))；蛞蝓屬 (*Limax*) (灰黑蛞蝓 (*L. cinereoniger*)、黃蛞蝓 (*L. flavus*)，邊緣蛞蝓 (*L. marginatus*)，大蛞蝓 (*L. maximus*)，柔蛞蝓 (*L. tenellus*))；椎實螺屬 (*Lymnaea*)；*Milax* (*M. gagates*、*M. marginatus*、*M. sowerbyi*)；鑽螺屬 (*Opeas*)；瓶螺屬 (*Pomacea*) (*P. canaticulata*)；瓦婁蝸牛屬 (*Vallonia*) 和 *Zanitoides*。

【0074】 術語“作物”應理解為還包括藉由使用重組 DNA 技術進行了轉化而能夠合成一種或多種選擇性作用的毒素的作物植物，該等毒素例如已知，例如來自產毒素的細菌，尤其是芽孢桿菌屬的細菌。

【0075】 可藉由所述轉基因植物表現的毒素包括，例如殺昆蟲蛋白質，例如來自於枯草芽孢桿菌或日本甲蟲芽孢桿菌的殺昆蟲蛋白質；或來

自於蘇雲金芽孢桿菌的殺昆蟲蛋白質，例如 δ -內毒素，例如 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1 或 Cry9C，或植物性殺昆蟲蛋白 (Vip)，例如 Vip1、Vip2、Vip3 或 Vip3A；或線蟲寄生性細菌的殺昆蟲蛋白質，例如光桿狀菌屬或致病桿菌屬，例如發光光桿狀菌、嗜線蟲致病桿菌；由動物產生的毒素，例如蠍毒素、蜘蛛毒素、黃蜂毒素和其他昆蟲特異性神經毒素；由真菌產生的毒素，例如鏈黴菌毒素；植物凝集素，例如豌豆凝集素、大麥凝集素或雪花蓮凝集素；凝集素類；蛋白酶抑制劑，例如胰蛋白酶抑制劑、絲胺酸蛋白酶抑制劑、馬鈴薯貯存蛋白 (patatin)、半胱胺酸蛋白酶抑制劑、木瓜蛋白酶抑制劑；核糖體失活蛋白 (RIP)，例如蓖麻蛋白、玉米-RIP、相思豆毒蛋白、絲瓜籽毒蛋白、皂草毒素蛋白或異株瀉根毒蛋白；類固醇代謝酶，例如 3-羥基類固醇氧化酶、蛻皮類固醇-UDP-糖苷基-轉移酶、膽固醇氧化酶、蛻皮激素抑制劑、HMG-CoA-還原酶，離子通道阻斷劑，例如鈉通道或鈣通道阻斷劑，保幼激素酯酶，利尿激素受體、萜合成酶、聯苳合成酶、幾丁酶和葡聚糖酶。

【0076】 在本發明背景下， δ -內毒素例如 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1 或 Cry9C，或營養期殺昆蟲蛋白 (Vip)，例如 Vip1、Vip2、Vip3 或 Vip3A 應理解為顯然還包括混合型毒素、截短的毒素和經修飾的毒素。混合型毒素係藉由那些蛋白的不同區域的新組合重組產生的 (參見，例如 WO 02/15701)。截短的毒素例如截短的 Cry1Ab 係已知的。在經修飾毒素的情況下，天然產生的毒素的一個或多個胺基酸被置換。在這種胺基酸置換中，較佳的是將非天然存在的蛋白酶識別序列插入毒素中，例如在 Cry3A055 的情況下，組織蛋白酶-G 識別序列被插入 Cry3A

毒素（參見 WO 03/018810）。

【0077】 這樣的毒素或能夠合成這樣的毒素的轉基因植物的更多實例揭露於例如 EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451 878 以及 WO 03/052073 中。

【0078】 用於製備這樣的轉基因植物的方法對於熟習該項技術者係已知的並且描述在例如以上提及的公開案中。CryI-型去氧核糖核酸及其製備例如從 WO 95/34656、EP-A-0 367 474、EP-A-0 401 979 以及 WO 90/13651 中已知。

【0079】 包括在轉基因植物中的毒素使得植物對有害昆蟲有耐受性。該等昆蟲可以存在於任何昆蟲分類群，但尤其是通常在甲蟲（鞘翅目）、雙翅昆蟲（雙翅目）和蛾（鱗翅目）中發現。

【0080】 包含一種或多種編碼殺昆蟲劑抗性並且表現一種或多種毒素的基因的轉基因植物係已知的並且其中一些係可商購的。此類植物的實例為：YieldGard®（玉米品種，表現 Cry1Ab 毒素）；YieldGard Rootworm®（玉米品種，表現 Cry3Bb1 毒素）；YieldGard Plus®（玉米品種，表現 Cry1AB 以及 Cry3Bb1 毒素）；Starlink®（玉米品種，表現 Cry9C 毒素）；Herculex I®（玉米品種，表現 Cry1Fa2 毒素以及實現對除草劑草丁膦銨的耐受性的酶膦絲菌素 N-乙醯轉移酶（PAT））；NuCOTN 33B®（棉花品種，表現 Cry1Ac 毒素）；Bollgard I®（棉花品種，表現 Cry1Ac 毒素）；Bollgard II®（棉花品種，表現 Cry1Ac 和 Cry2Ab 毒素）；VipCot®（棉花品種，表現 Vip3A 和 Cry1Ab 毒素）；NewLeaf®（馬鈴薯品種，表現 Cry3A 毒素）；Nature-Gard®，Agrisure® GT Advantage（GA21 耐草甘膦性狀），Agrisure® CB Advantage（Bt11 玉米螟（CB）

性狀) 以及 Protecta®。

【0081】 這樣的轉基因作物的其他實例係：

1.Bt11 玉米，來自先正達種子公司 (Syngenta Seeds SAS)，霍比特路 (Chemin de l' Hobit) 27，F-31 790 聖蘇維爾 (St. Sauveur)，法國，登記號 C/FR/96/05/10。遺傳修飾的玉蜀黍，藉由轉基因表現截短的 Cry1Ab 毒素，使之能抵抗歐洲玉米螟 (玉米螟和粉莖螟) 的侵襲。Bt11 玉米還轉基因地表現 PAT 酶以達到對除草劑草丁膦銨鹽的耐受性。

2.Bt176 玉米，來自先正達種子公司，霍比特路 27，F-31 790 聖蘇維爾，法國，登記號 C/FR/96/05/10。遺傳修飾的玉蜀黍，藉由轉基因表現 Cry1Ab 毒素，使之能抵抗歐洲玉米螟 (玉米螟和粉莖螟) 的侵襲。Bt176 玉米還轉基因地表現 PAT 酶以達到對除草劑草丁膦銨鹽的耐受性。

3.MIR604 玉米，來自先正達種子公司，霍比特路 27，F-31 790 聖蘇維爾，法國，登記號 C/FR/96/05/10。藉由轉基因表現經修飾的 Cry3A 毒素使之具有昆蟲抗性的玉米。此毒素係藉由插入組織蛋白酶-G-蛋白酶識別序列而經修飾的 Cry3A055。此類轉基因玉米植物的製備描述於 WO 03/018810 中。

4.MON 863 玉米，來自孟山都歐洲公司 (Monsanto Europe S.A.) 270-272 特弗倫大道 (Avenue de Tervuren)，B-1150 布魯塞爾 (Brussels)，比利時，登記號 C/DE/02/9。MON 863 表現 Cry3Bb1 毒素，並且對某些鞘翅目昆蟲有抗性。

5.IPC 531 棉花，來自孟山都歐洲公司，270-272 特弗倫大道，B-1150 布魯塞爾，比利時，登記號 C/ES/96/02。

6.1507 玉米，來自先鋒海外公司 (Pioneer Overseas Corporation)，特德斯

科大道 (Avenue Tedesco), 7 B-1160 布魯塞爾, 比利時, 登記號 C/NL/00/10。遺傳修飾的玉米, 表現蛋白質 Cry1F 以獲得對某些鱗翅目昆蟲的抗性, 並且表現 PAT 蛋白質以獲得對除草劑草丁膦銨鹽的耐受性。

7.NK603 × MON 810 玉米, 來自孟山都公司 (Monsanto Europe S.A.), 270-272 特弗倫大道, B-1150 布魯塞爾, 比利時, 登記號 C/GB/02/M3/03。藉由將遺傳修飾的品種 NK 603 和 MON 810 雜交, 由常規育種的雜交玉米品種構成。NK603 × MON 810 玉米轉基因表現由土壤桿菌屬菌株 CP4 獲得的 CP4 EPSPS 蛋白質, 使之耐除草劑 Roundup® (含有草甘膦), 以及由蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克亞種獲得的 Cry1Ab 毒素, 使之耐某些鱗翅目昆蟲, 包括歐洲玉米螟。

【0082】 抗昆蟲的植物的轉基因作物還描述於 BATS (生物安全與可持續發展中心 (Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit), BATS 中心 (Zentrum BATS), 克拉斯崔舍 (Clarastrasse) 13, 巴塞爾 (Basel) 4058, 瑞士) 報告 2003 (<http://bats.ch>) 中。

【0083】 術語“作物”應當被理解為還包括已經藉由使用重組 DNA 技術而被這樣轉化使其能夠合成具有選擇性作用的抗病原物質的作物, 該等抗病原物質例如所謂的“病程相關蛋白”(PRP, 參見例如 EP-A-0 392 225)。此類抗病原物質以及能夠合成此類抗病原物質的轉基因植物的實例例如從 EP-A-0 392 225、WO 95/33818 和 EP-A-0 353 191 係已知的。生產該等轉基因植物的該等方法對於熟習該項技術者係普遍已知的並且描述在例如以上提及的公開物中。

【0084】 作物也可以經修飾以增加對真菌(例如鐮刀黴、炭疽病或疫

黴菌)、細菌(例如假單胞菌)或病毒(例如馬鈴薯卷葉病毒、番茄斑萎病毒、黃瓜花葉病毒)病原體的抗性。

【0085】 作物還包括那些具有對線蟲(如大豆胞囊線蟲)的增加的抗性的作物。

【0086】 具有對非生物性脅迫的耐受性的作物包括那些例如藉由 NF-YB 或本領域中已知的其他蛋白質的表現具有對乾旱、高鹽、高溫、寒冷、霜、或光輻射增加的耐受性的作物。

【0087】 可以藉由該等轉基因植物表現的抗病原物質包括例如離子通道阻斷劑，例如鈉通道和鈣通道的阻斷劑，例如病毒性 KP1、KP4 或 KP6 毒素；芪合成酶；聯苳合成酶；幾丁質酶；葡聚糖酶；所謂的“發病機制相關蛋白質”(PRP；參見例如 EP-A-0 392 225)；由微生物產生的抗病原物質，例如肽抗生素或雜環抗生素(參見例如 WO 95/33818)或參與植物病原體防禦的蛋白質或多肽因數(所謂的“植物抗病基因”，如 WO 03/000906 中所述)。

【0088】 根據本發明的組成物的其他使用領域係保護所儲存的貨物和儲藏室並且保護原材料，例如木材、紡織品、地板或建築物，以及在衛生部門中，尤其是保護人類、家畜以及多產的牲畜免遭所提及類型的有害生物。

【0089】 本發明還提供了用於控制有害生物(如蚊科和其他的疾病媒介物；同樣參見 http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/)的方法。在一個實施方式中，用於控制有害生物的方法包括藉由塗刷、軋製、噴霧、塗布或浸漬，向該目標有害生物、它們的場所或表面或基底施用本發明的

組成物。藉由舉例，藉由本發明的方法預期了表面（如，牆、天花板或地板表面）的 IRS（室內滯留噴霧）施用。在另一個實施方式中，考慮到了將此類組成物施用於基底，如無紡或織物材料，該材料處於網織品、被覆物、被褥、窗簾以及帳篷的形式（或可以用於在該等物品的製造中使用）。

【0090】 在另一個實施方式中，用於控制此類有害生物的方法包括向該目標有害生物、它們的場所或表面或基底施用殺有害生物有效量的本發明的組成物，以便於在該表面或基底上提供有效的滯留的殺有害生物活性。此類施用可以藉由塗刷、軋製、噴霧、塗布或浸漬本發明的殺有害生物組成物來進行。藉由舉例，本發明的方法預期了表面（如，牆、天花板或地板表面）的 IRS 施用，以便於在該表面上提供有效的滯留的殺有害生物活性。在另一個實施方式中，預期了施用此類組成物以用於在基底上的有害生物的滯留的控制，該基底係例如處於網織品、被覆物、被褥、窗簾以及帳篷的形式（或可以用於在該等物品的製造中使用）的織物材料。

【0091】 有待處理的基底（包括無紡物、織物或網織品）可以由天然纖維，如，棉花、拉菲亞樹葉纖維、黃麻、亞麻、劍麻、粗麻布或羊毛，或合成纖維，如聚醯胺、聚酯、聚丙烯、聚丙烯腈等等製成。聚酯係特別適合的。紡織品處理的方法係已知的，例如 WO 2008/151984、WO 2003/034823、US 5631072、WO 2005/64072、WO 2006/128870、EP 1724392、WO 2005113886 或 WO 2007/090739。

【0092】 根據本發明的該等組成物的用途的其他範圍係針對所有觀賞樹木連同所有種類的果樹和堅果樹的樹木注射/樹幹處理領域。

【0093】 在樹木注射/樹幹處理領域中，根據本發明的該等化合物特

別適合於對抗來自上述的鱗翅目和來自鞘翅目的鑽木昆蟲，尤其是對抗下

表 A 和 B 中列出的鑽木蟲：

表 A.具有經濟重要性的外來鑽木蟲的實例。

科	種	受侵染的宿主或作物
吉丁蟲科	白蠟窄吉丁	梣木 (Ash)
天牛科	光肩天牛	硬木
	<i>Xylosandrus crassiusculus</i>	硬木
小蠹科	削尾材小蠹	硬木
	縱坑切梢小蠹	松柏類

表 B.具有經濟重要性的本地鑽木蟲的實例。

科	種	受侵染的宿主或作物
	樺銅窄吉丁 (<i>Agrilus anxius</i>)	樺樹
	磨光窄吉丁 (<i>Agrilus politus</i>)	柳樹、楓樹
	<i>Agrilus sayi</i>	楊梅、香蕨木
	<i>Agrilus vittaticollis</i>	蘋果樹、梨樹、蔓越橘、唐 棣、山楂樹
吉丁蟲 科	蘋扁頭吉丁 (<i>Chrysobothris femorata</i>)	蘋果、杏、山毛櫸、白蠟槭、 櫻桃樹、栗樹、紅醋栗樹、 榆樹、山楂樹、樺樹、山核 桃、歐洲七葉樹、菩提樹、 楓樹、歐洲花楸樹、橡樹、 美洲山核桃樹、梨樹、桃樹、

科	種	受侵染的宿主或作物
	<i>Texania campestris</i>	柿子樹、李子樹、楊樹、溫柏、美國紫荊、唐棣、美國梧桐、核桃樹、柳樹 椴木、山毛櫸、楓樹、橡樹、美國梧桐、柳樹、黃楊
	對山毛櫸天牛 (<i>Goes pulverulentus</i>)	山毛櫸、榆樹、納托爾 (Nuttall)、柳樹、黑橡樹、櫻皮鑷狀櫟、黑櫟、美國梧桐
	虎橡天牛 (<i>Goes tigrinus</i>)	橡樹
	黑腹尼虎天牛 (<i>Neoclytus acuminatus</i>)	白蠟木、山核桃樹、橡樹、核桃樹、樺樹、山毛櫸、楓樹、美洲鐵木 (Eastern hophornbeam)、山茱萸、柿子樹、美國紫荊、冬青、樸樹、洋槐、美國皂莢木 (Honeylocust)、黃楊、栗樹、奧塞奇橙木 (Osage-orange)、黃樟、紫丁香、短葉紫杉 (Mountain-mahogany)、梨樹、櫻桃樹、李子樹、桃樹、

天牛科

科	種	受侵染的宿主或作物
		蘋果樹、榆樹、菩提樹、楓香
	三線無花果天牛（ <i>Neoptychodes trilineatus</i> ）	無花果樹、赤楊木、桑樹、柳樹、網葉樺樹（Netleaf hackberry）
	灰翅筒天牛（ <i>Oberea ocellata</i> ）	漆樹、蘋果樹、桃樹、李子樹、梨樹、紅醋栗樹、黑莓
	<i>Oberea tripunctata</i>	山茱萸、莢蒾屬、榆樹、酸模樹、藍莓、杜鵑花屬、杜鵑、月桂樹、楊樹、柳樹、桑樹
	繞枝溝脛天牛（ <i>Oncideres cingulata</i> ）	山核桃樹、美洲山核桃樹、柿子樹、榆樹、酸模樹、菩提樹、美國皂莢木、山茱萸、桉樹、橡樹、樺樹、楓樹、果樹
	對楊黃斑楔天牛（ <i>Saperda calcarata</i> ）	楊樹
	<i>Strophiona nitens</i>	栗樹、橡樹、山核桃樹、核桃樹、山毛櫸、楓樹
小蠹科	<i>Corthylus columbianus</i>	楓樹、橡樹、黃楊、山毛櫸、白蠟槭、美國梧桐、樺樹、

科	種	受侵染的宿主或作物
		菩提樹、栗樹、榆樹
	南方松大小蠹 (<i>Dendroctonus frontalis</i>)	松樹
	美樺毛小蠹 (<i>Dryocoetes betulae</i>)	樺樹、楓香、野櫻桃樹、山毛櫸、梨樹
	黃帶芳小蠹 (<i>Monarthrum fasciatum</i>)	橡樹、楓樹、樺樹、栗樹、楓香、藍果木、楊樹、山核桃樹、含羞草、蘋果樹、桃樹、松樹
	桃鰓角小蠹 (<i>Phloeotribus liminaris</i>)	桃樹、櫻桃樹、李子樹、黑櫻桃樹、榆樹、桑樹、歐洲花楸樹
	<i>Pseudopityophthorus pruinus</i>	橡樹、美國山毛櫸木、黑櫻桃樹、契卡索李子樹 (Chickasaw plum)、栗樹、楓樹、山核桃樹、角樹、鐵木
	棟透翅蛾 (<i>Paranthrene simulans</i>)	橡樹、美洲栗樹
透翅蛾	<i>Sannina uroceriformis</i>	柿子樹
科	小桃翅蛾	桃樹、李子樹、油桃樹、櫻桃樹、杏樹、扁桃樹、黑櫻桃樹

科	種	受侵染的宿主或作物
	李桃翅蛾 (<i>Synanthedon pictipes</i>)	桃樹、李子樹、櫻桃樹、山毛櫸、黑櫻桃樹
	<i>Synanthedon rubrofascia</i>	藍果樹
	<i>Synanthedon scitula</i>	山茱萸、美洲山核桃、山核桃樹、橡樹、栗樹、山毛櫸、樺樹、黑櫻桃樹、榆樹、花楸樹、莢蒾屬、柳樹、蘋果樹、枇杷樹、九層皮 (Ninebark)、楊梅
	<i>Vitacea polistiformis</i>	葡萄樹

【0094】 在衛生領域中，根據本發明的該等組成物係有效地對抗外寄生蟲如硬蜱、軟蜱、疥蟎、秋蟎、蠅（叮咬和舔舐）、寄生性蠅幼蟲，虱、發虱、鳥虱和蚤。

【0095】 此類寄生蟲的實例係：

虱目：血虱屬、長鬚虱屬、人虱屬以及陰虱屬、管虱屬。

食毛目：毛羽虱屬 (Trimenopon spp.)、短角鳥虱屬 (Menopon spp.)、鴨虱屬 (Trinoton spp.)、牛羽虱屬 (Bovicola spp.)、Werneckiella 屬 (Werneckiella spp.)、Lepikentron 屬 (Lepikentron spp.)、畜虱屬 (Damalina spp.)、鬣毛虱屬 (Trichodectes spp) 以及貓羽虱屬 (Felicola spp.)。

雙翅目及長角亞目和短角亞目，例如伊蚊屬 (Aedes spp.)、按蚊屬 (Anopheles spp.)、庫蚊屬 (Culex spp.)、蚋屬 (Simulium spp.)、真蚋屬

(*Eusimulium* spp.)、白蛉屬(*Phlebotomus* spp.)、羅蛉屬(*Lutzomyia* spp.)、庫蠓屬(*Culicoides* spp.)、斑虻屬(*Chrysops* spp.)、駝背虻屬(*Hybomitra* spp.)、黃虻屬(*Atylotus* spp.)、虻屬(*Tabanus* spp.)、麻虻屬(*Haematopota* spp.)、*Philipomyia* spp.、蜂虱蠅屬(*Braula* spp.)、家蠅屬(*Musca* spp.)、齒股蠅屬(*Hydrotaea* spp.)、螫蠅屬(*Stomoxys* spp.)、黑角蠅屬(*Haematobia* spp.)、莫蠅屬(*Morellia* spp.)、廁蠅屬(*Fannia* spp.)、舌蠅屬(*Glossina* spp.)、麗蠅屬(*Calliphora* spp.)、綠蠅屬(*Lucilia* spp.)、金蠅屬(*Chrysomyia* spp.)、汙蠅屬(*Wohlfahrtia* spp.)、麻蠅屬(*Sarcophaga* spp.)、狂蠅屬(*Oestrus* spp.)、皮蠅屬(*Hypoderma* spp.)、胃蠅屬(*Gasterophilus* spp.)、虱蠅屬(*Hippobosca* spp.)、羊虱蠅屬(*Lipoptena* spp.)和蜚蠊屬(*Melophagus* spp.)。

蚤目，例如屬(*Pulex* spp.)、櫛頭蚤屬(*Ctenocephalides* spp.)、客蚤屬(*Xenopsylla* spp.)、角葉蚤屬(*Ceratophyllus* spp.)。

異翅目，例如臭蟲屬(*Cimex* spp.)、錐蝨屬(*Triatoma* spp.)、紅獵蝨屬(*Rhodnius* spp.)、錐蝨屬(*Panstrongylus* spp.)。

蜚蠊目，例如東方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、美洲大蠊(*Periplaneta americana*)、德國小蠊(*Blattella germanica*)以及夏柏拉蟑螂屬(*Supella* spp.)。

蜱蟎亞綱(蟎科)和後氣門目和中氣門目，例如銳緣蜱屬(*Argas* spp.)、鈍緣蜱屬(*Ornithodoros* spp.)、耳蜱屬(*Otobius* spp.)、硬蜱屬(*Ixodes* spp.)、鈍眼蜱屬(*Amblyomma* spp.)、牛蜱屬(*Boophilus* spp.)、革蜱屬(*Dermacentor* spp.)、血蜱屬(*Haemophysalis* spp.)、璃眼蜱屬(*Hyalomma* spp.)、扇頭蜱屬(*Rhipicephalus* spp.)、皮刺蟎屬(*Dermanyssus* spp.)、刺利蟎屬(*Raillietia* spp.)、肺刺蟎屬(*Pneumonyssus* spp.)、胸刺蟎屬(*Sternostoma* spp.)和瓦蟎

屬 (Varroa spp.)。

軸蟎目(前氣門亞目)和粉蟎目(無氣門亞目),例如蜂盾蟎屬(Acarapis spp.)、姬螯屬(Cheyletiella spp.)、禽螯蟎屬(Ornithocheyletia spp.)、肉蟎屬(Myobia spp.)、瘡蟎屬(Psorergates spp.)、蠕形蟎屬(Demodex spp.)、恙蟎屬(Trombicula spp.)、犛蟎屬(Listrophorus spp.)、粉蟎屬(Acarus spp.)、食酪蟎屬(Tyrophagus spp.)、嗜木蟎屬(Caloglyphus spp.)、頸下蟎屬(Hypodectes spp.)、翅蟎屬(Pterolichus spp.)、癢蟎屬(Psoroptes spp.)、皮蟎屬(Chorioptes spp.)、耳疥蟎屬(Otodectes spp.)、疥蟎屬(Sarcoptes spp.)、耳蟎屬(Notoedres spp.)、鳥疥蟎屬(Knemidocoptes spp.)、胞蟎屬(Cytodites spp.)以及雞雛蟎屬(Laminosioptes spp.)。

【0096】 根據本發明的該等組成物還適用於保護材料如木材、紡織品、塑膠、粘合劑、膠、漆料、紙張和卡片、皮革、地板和建築等免受昆蟲侵染。

【0097】 根據本發明的組成物可以用於例如抵抗以下有害生物：甲蟲，例如北美家天牛(Hylotrupes bajulus)、長毛天牛(Chlorophorus pilosis)、傢俱竊蠹(Anobium punctatum)、紅毛竊蠹(Xestobium rufovillosum)、梳角細脈竊蠹(Ptilinuspecticornis)、石斛(Dendrobium pertinex)、松芽枝竊蠹(Ernobius mollis)、松產品竊蠹(Priobium carpini)、褐粉蠹(Lyctus brunneus)、非洲粉蠹(Lyctus africanus)、南方粉蠹(Lyctus planicollis)、櫟粉蠹(Lyctus linearis)、柔毛粉蠹(Lyctus pubescens)、胸粉蠹(Trogoxylon aequale)、鱗毛粉蠹(Minthesrugicollis)、材小蠹屬(Xyleborus spec.)、條木小蠹屬(Tryptodendron spec.)、咖啡黑長蠹(Apate monachus)、樹長蠹(Bostrychus

capucins)、棕異翅長蠹 (*Heterobostrychus brunneus*)、雙棘長蠹屬與竹長蠹 (*Sinoxylon spec.* and *Dinoderus minutus*)、例如藍黑樹蜂 (*Sirex juvencus*)、雲杉大樹蜂 (*Urocerus gigas*)、泰加大樹蜂與大樹蜂 (*Urocerus gigas taignus* and *Urocerus augur*)、以及白蟻 (termites)、歐洲木白蟻 (*Kaloterms flavicollis*)、麻頭堆砂白蟻 (*Cryptotermes brevis*)、印巴結構木異白蟻 (*Heterotermes indicola*)、黃胸散白蟻 (*Reticulitermes flavipes*)、桑特散白蟻 (*Reticulitermes santonensis*)、散白蟻 (*Reticulitermes lucifugus*)、達爾文澳白蟻 (*Mastotermes darwiniensis*)、內華達古白蟻 (*Zootermopsis nevadensis*) 與家白蟻 (*Coptotermes formosanus*)；以及蛀蟲，例如衣魚。

【0098】 在一個方面中，本發明因此也涉及殺有害生物組成物，例如在聚合性物質中的可乳化性濃縮物、懸浮液濃縮物、微乳液、油分散劑、直接可噴霧或可稀釋的溶液、可塗抹的糊劑、稀乳液、可溶性粉劑、可分散性粉劑、可濕性粉劑、塵劑、顆粒劑或封裝劑，該等殺有害生物組成物包含根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的活性成分中的至少一種並且被選擇用來適合既定目標和當時環境。在該等組成物中，活性成分係以純形式採用的，例如呈一個具體粒度的固體活性成分，或較佳的是與配製物領域中常規地使用的助劑中的至少一種一起，該等助劑例如增量劑，例如溶劑或固體載體，或例如表面活性化合物（表面活性劑）。

【0099】 適合的溶劑的實例係：未氫化的或部分氫化的芳族烴，較佳的是 C₈ 至 C₁₂ 的烷基苯部分，如二甲苯混合物、烷基化的萘或四氫化萘、脂肪族的或脂環族的烴，如石蠟或環己烷，醇類如乙醇、丙醇或丁醇、二醇及它們的醚類和酯類如丙二醇、雙丙甘醇醚、乙二醇或乙二醇單甲醚或己

二醇單乙醚，酮類，如環己酮、異佛爾酮或雙丙酮醇，強極性溶劑，如 N-甲基吡咯啉-2-酮、二甲亞砷或 N,N-二甲基甲醯胺、水，未環氧化的或環氧化的植物油，如未環氧化的或環氧化的菜籽油、蓖麻油、椰子油或大豆油和矽油。

【0100】 用於例如塵劑和可分散性粉劑的固體載體通常是經研磨的天然礦物，例如方解石、滑石、高嶺土、蒙脫石或凹凸棒石。為了改良物理性質，添加高度分散的矽石或高度分散的吸收性聚合物也是可能的。用於顆粒劑的合適的吸附性載體係多孔型的，例如浮石、磚礫、海泡石或膨潤土，並且合適的非吸附性載體材料係方解石或沙。此外，可以使用大量無機或有機天然物的顆粒化材料，特別是白雲石或粉碎的植物殘餘料。

【0101】 取決於待配製的活性成分的類型，合適的表面活性化合物係非離子型、陽離子型和/或陰離子型表面活性劑或表面活性劑混合物，它們具有良好的乳化、分散以及濕潤特性。以下提及的表面活性劑僅視為實例；在配製物領域中常規地使用的且根據本發明適宜的大量其他表面活性劑描述於相關文獻中。

【0102】 合適的非離子型表面活性劑尤其是脂肪族或環脂肪族醇、飽和或不飽和脂肪酸或烷基酚的聚乙二醇醚衍生物，該等衍生物可以包括約 3 個到約 30 個乙二醇醚基團並且在（環）脂肪族烴基團中的約 8 個到約 20 個碳原子或在烷基酚的烷基部分中的約 6 個到約 18 個碳原子。也合適的是水溶性聚氧化乙烯與聚丙二醇、乙二胺基聚-丙二醇或烷基聚丙二醇的加合物，該等加合物具有在烷基鏈中的 1 個到約 10 個碳原子和約 20 個到約 250 個乙二醇醚基團以及約 10 個到約 100 個丙二醇醚基團。通常，以上提及的

化合物包括每聚乙二醇單元 1 個到約 5 個乙二醇單元。可以提及的實例係壬苯氧基聚乙氧基乙醇 (nonylphenoxypolyethoxyethanol)、蓖麻油聚乙二醇醚、聚丙二醇/聚環氧乙烷加合物、三丁基苯氧基聚乙氧基乙醇、聚乙二醇或辛基苯氧基聚乙氧基乙醇。也合適的是聚氧基乙烯脫水山梨醇的脂肪酸酯，例如聚氧基乙烯脫水山梨醇三油酸酯。

【0103】 陽離子型表面活性劑尤其是季銨鹽，該等季銨鹽總體上具有至少一個烷基，該烷基中約 8 個到約 22 個 C 原子作為取代基並且作為進一步取代基（未鹵化或鹵化）低碳數烷基或羥基烷基或苄基。該等鹽較佳的是以鹵化物、甲基硫酸鹽或乙基硫酸鹽的形式。實例係硬脂醯基三甲基氯化銨和苄基雙(2-氯乙基)乙基溴化銨。

【0104】 適宜的陰離子型表面活性劑的實例係水溶性皂類或水溶性合成的表面活性化合物。合適的皂類的實例係具有約 10 個到約 22 個 C 原子的脂肪酸的鹼金屬鹽、鹼土金屬鹽或（未被取代的或被取代的）銨鹽，例如油酸或硬脂酸的鈉鹽或鉀鹽、或例如從椰子或妥爾油可獲得的天然脂肪酸混合物的鈉鹽或鉀鹽；還必須提及的是脂肪酸甲基牛磺酸鹽。然而，更常用的是合成的表面活性劑，特別是脂肪磺酸鹽、脂肪硫酸鹽、磺化的苯並咪唑衍生物或烷基芳基磺酸鹽。通常，脂肪磺酸鹽和脂肪硫酸鹽係以鹼金屬鹽、鹼土金屬鹽或（被取代或未被取代的）銨鹽形式存在的並且該等鹽總體上具有約 8 個到約 22 個 C 原子的烷基，烷基也應該理解為包括醯基的烷基部分；可以提及的實例係木質素磺酸、十二烷基硫酸酯或從天然脂肪酸製備的脂肪醇硫酸酯混合物的鈉鹽或鈣鹽。該組還包括脂肪醇/環氧乙烷加合物的硫酸酯鹽和磺酸鹽。該等磺化的苯並咪唑衍生物較佳的是包

含 2 個磺基基團和具有約 8 到約 22 個 C 原子的脂肪酸殘基。烷基芳基磺酸鹽的實例係癸基苯磺酸、二丁基萘磺酸或萘磺酸/甲醛縮合物的鈉鹽、鈣鹽或三乙醇銨鹽。此外，還可能的是適合的磷酸鹽，例如對壬基苯酚/(4-14)環氧乙烷加合物的磷酸酯鹽，或磷脂鹽。

【0105】 通常情況下，該等組成物包括 0.1%到 99%（尤其是 0.1%到 95%）的活性成分以及 1%到 99.9%（尤其是 5%到 99.9%）的至少一種固體或液體佐劑，原則上可能的是該組成物的 0 到 25%（尤其是 0.1%到 20%）為表面活性劑（在每種情況下%表示重量百分比）。儘管對於商品而言，濃縮的組成物通常是較佳的，但是終端使用者通常使用具有實質上更低濃度的活性成分的稀釋組成物。

【0106】 典型地，用於葉施用的預混配製物包括 0.1%至 99.9%，尤其是 1%至 95%的所希望的成分，以及 99.9%至 0.1%，尤其是 99%至 5%的固體或液體佐劑（包括例如溶劑，例如水），其中該等助劑可以是表面活性劑，其量基於該預混配製物係 0 至 50%，尤其是 0.5%至 40%。

【0107】 通常，用於種子處理施用的桶混配製物包括 0.25%至 80%，尤其是 1%至 75%的所希望的成分，以及 99.75%至 20%，尤其是 99%至 25%的固體或液體助劑（包括例如溶劑，如水），其中該等助劑可以是表面活性劑，其量基於該桶混配製物係 0 至 40%，尤其是 0.5%至 30%。

【0108】 典型地，用於種子處理施用的預混配製物包括 0.5%至 99.9%，尤其是 1%至 95%的所希望的成分，以及 99.5%至 0.1%，尤其是 99%至 5%的固體或液體佐劑（包括例如溶劑，例如水），其中該等助劑可以是表面活性劑，其量基於該預混配製物係 0 至 50%，尤其是 0.5%至 40%。

【0109】 而商用的產品較佳的是被配製為濃縮物（例如，預混組成物（配製物）），最終使用者通常使用稀釋的配製物（例如，儲箱混合組成物）。

【0110】 較佳的種子處理預混配製物係水性懸浮液濃縮物。該配製物可以使用常規的處理技術以及機器，例如流化床技術、滾筒研磨方法、靜態轉動（rotostatic）種子處理器以及轉鼓包衣器施用到種子上。其他方法，例如噴出床也可以是有用的。該等種子可以在包衣之前進行預上漿。包衣之後，將該等種子典型地進行乾燥並且然後轉移到上漿機器中用於上漿（sizing）。這樣的方法在本領域中是熟知的。

【0111】 總體上，本發明的預混組成物包括按質量計 0.5%至 99.9%，尤其是 1%至 95%，有利地 1%至 50%的所希望的成分，以及按質量計 99.5%至 0.1%，尤其是 99%至 5%的固體或液體佐劑（包括例如一種溶劑，例如水），其中該等助劑（或佐劑）可以是表面活性劑，其量基於該預混配製物係按質量計 0 至 50%，尤其是 0.5%至 40%。

用於預混組成物的葉配製物類型的實例係：

GR：顆粒劑

WP：可濕性粉劑

WG：水可分散顆粒（粉末）劑

SG：水溶性顆粒劑

SL：可溶的濃縮物

EC：可乳化的濃縮物

EW：乳液，水包油

ME：微乳液

SC：水性懸浮液濃縮物

CS：水性膠囊懸浮液

OD：基於油的懸浮液濃縮物，以及

SE：水性懸乳液。

而用於預混組成物的種子處理配製物類型的實例係：

WS：用於種子處理漿料的可濕性粉劑

LS：用於種子處理的溶液

ES：用於種子處理的乳液

FS：用於種子處理的懸浮液濃縮物

WG：水可分散顆粒劑，以及

CS：水性膠囊懸浮液。

適合於桶混組成物的配製物類型的例子係溶液、稀釋乳液、懸浮液或其混合物、以及塵劑。

特別地，較佳的組成物組成如下（% = 重量百分比）：

可乳化性濃縮物：

活性成分：1%至 95%，較佳的是 5%至 20%

表面活性劑：1%至 30%，較佳的是 10%至 20%

溶劑：5%至 98%，較佳的是 70%至 85%

塵劑：

活性成分：0.1%至 10%，較佳的是 0.1%至 1%

固體載體：99.9%至 90%，較佳的是 99.9%至 99%

懸浮液濃縮物：

活性成分： 5%至 75%，較佳的是 10%至 50%

水： 94%至 24%，較佳的是 88%至 30%

表面活性劑： 1%至 40%，較佳的是 2%至 30%

可濕性粉劑：

活性成分： 0.5%至 90%，較佳的是 1%至 80%

表面活性劑： 0.5%至 20%，較佳的是 1%至 15%

固體載體： 5%至 99%，較佳的是 15%至 98%

顆粒劑：

活性成分： 0.5%至 30%，較佳的是 3%至 15%

固體載體： 99.5%至 70%，較佳的是 97%至 85%

實驗

以下該等實施例展示但不限制本發明。

實施例：

以下化合物可根據在此所述的方法或根據已知的方法製備。

製備實施例：

【0112】 “Mp” 係指以℃ 計的熔點。¹H NMR 測量值在 Brucker 400MHz 分光計上記錄，化學位移相對於 TMS 標準品以 ppm 給出。光譜在如指定的氘代溶劑中測量。

LC MS 方法 A：標準：

【0113】 在來自沃特斯的質譜儀（SDQ 或 ZQ 單四極桿質譜儀）上記錄光譜，該質譜儀配備有電灑源（極性：正離子或負離子，毛細管：3.00 kV，錐孔範圍（Cone range）：30 V-60 V，萃取器：2.00 V，源溫度：150℃，去溶

劑化溫度：350°C，錐孔氣體流量：0 L/Hr，去溶劑化氣體流量：650 L/Hr；
 質量範圍：100 Da 至 900 Da）以及來自沃特斯的 Acquity UPLC：二元泵、
 加熱管柱室以及二極體陣列檢測器）。溶劑脫氣裝置，二元泵，加熱柱室以
 及二極體陣列檢測器。管柱：沃特斯（Waters）UPLC HSS T3，1.8 μ m，30
 x 2.1 mm，溫度：60°C；DAD 波長範圍（nm）：210 到 500，溶劑梯度：A = 水
 + 5% MeOH + 0.05% HCOOH，B = 乙腈 + 0.05% HCOOH；梯度：0 min
 0% B, 100% A；1.2-1.5 min 100% B；流量（ml/min）0.85。

LC MS 方法 B：標準長：

【0114】 在來自沃特斯的質譜儀（SDQ 或 ZQ 單四極桿質譜儀）上記
 錄光譜，該質譜儀配備有電灑源（極性：正離子或負離子，毛細管：3.00 kV，
 錐孔範圍（Cone range）：30 V-60 V，萃取器：2.00 V，源溫度：150°C，去溶
 劑化溫度：350°C，錐孔氣體流量：0 L/Hr，去溶劑化氣體流量：650 L/Hr；
 質量範圍：100 Da 至 900 Da）以及來自沃特斯的 Acquity UPLC：二元泵、
 加熱管柱室以及二極體陣列檢測器）。溶劑脫氣裝置，二元泵，加熱柱室以
 及二極體陣列檢測器。管柱：沃特斯 UPLC HSS T3，1.8 μ m，30 x 2.1 mm，
 溫度：60°C；DAD 波長範圍（nm）：210 至 500，溶劑梯度：A = 水 + 5% MeOH
 + 0.05% HCOOH，B = 乙腈 + 0.05% HCOOH；梯度：0 min 0% B，100%
 A；2.7-3.0 min 100% B；流量（ml/min）0.85。

LC MS 方法 C

【0115】 來自沃特斯公司（Waters）的 ACQUITY SQD 質譜儀（單四
 極桿質譜儀）

離子化方法：電灑

極性：正離子

毛細管電壓 (kV) 3.00，錐孔電壓 (V) 20.00，提取器 (V) 3.00，源溫度 (°C) 150，去溶劑化溫度 (°C) 400，錐孔氣體流量 (L/Hr) 60，去溶劑化氣體流量 (L/Hr) 700

質量範圍：100 Da 至 800 Da

DAD 波長範圍 (nm)：210 至 400

方法：使用以下 HPLC 梯度條件的沃特斯 ACQUITY UPLC

(溶劑 A：水/甲醇 9：1，0.1%的甲酸和溶劑 B：乙腈，0.1%甲酸)

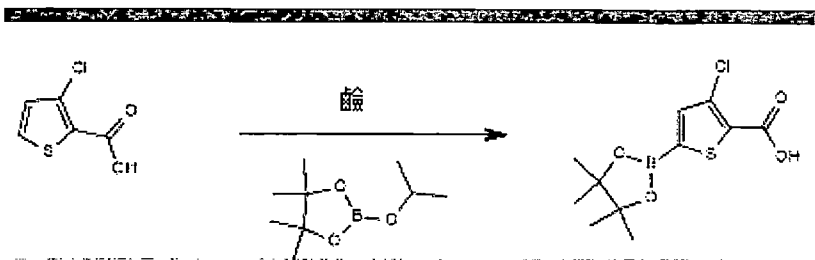
時間 (分鐘)	A (%)	B (%)	流速 (ml/min)
0	100	0	0.75
2.5	0	100	0.75
2.8	0	100	0.75
3.0	100	0	0.75

管柱類型：沃特斯的 ACQUITY UPLC HSS T3；管柱長度：30 mm；管柱內徑：2.1 mm；顆粒尺寸：1.8 微米；溫度：60°C。

實施例 1 和 2：3-氯-N-環丙基-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-2-甲醯胺（實施例 1）

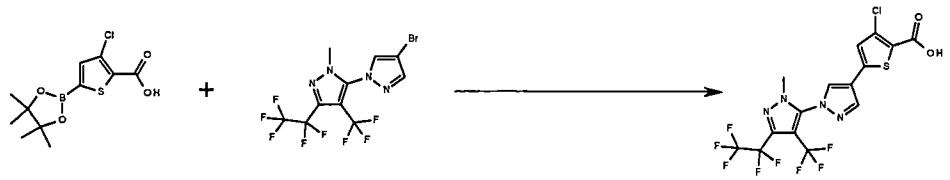
和 3-氯-N-(1-氰基環丙基)-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-2-甲醯胺（實施例 2）

步驟 A：3-氯-5-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜環戊硼烷（dioxaborolan）-2-基)噻吩-2-甲酸的製備



【0116】 向冷卻至-75°C 的 3-氯噻吩-2-甲酸 (1.5 g) 在四氫呋喃 (63 mL) 中的溶液中，加入二異丙基醯胺鋰在 THF/己烷中的溶液 (1 M, 28 mL)，並且將該溶液在-75°C 下攪拌持續 30 分鐘。使反應溫度上升至-30°C 並且將該溶液在此溫度下攪拌持續 20 分鐘。逐滴添加 2-異丙氧基-4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜環戊硼烷 (4.1 mL) 並且使反應升溫至室溫。將該反應混合物在室溫下攪拌 16 小時，然後將其倒入 HCl (0.1 M) 的溶液中。將混合物在乙酸乙酯與水之間萃取兩次。將合併的有機層用 MgSO₄ 乾燥、過濾並且蒸發以給出粗殘餘物，將該粗殘餘物吸收在 isolate 上並且藉由使用 0-40% EtOAc/甲醇的層析 (使用 combiflash Rf 機器) 純化以給出 2.26 g 的希望化合物。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 1.29 (s, 12 H) 7.49 (s, 1 H) 13.62 (br. s., 1 H)

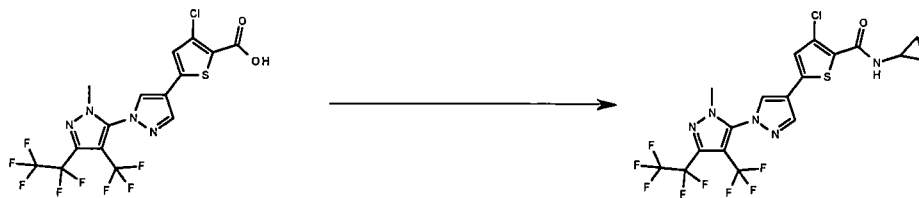
步驟 B：3-氯-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-2-甲酸的製備



【0117】 向 3-氯-5-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜環戊硼烷-2-基)噻吩-2-甲酸 (0.50 g) 溶解在 1,2-二甲氧基乙烷 (17 mL) 中的溶液中加入碳酸鉀 (1.2 g) 和 5-(4-溴吡唑-1-基)-1-甲基-3-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑 (描

述於 WO/2014122083 在第 76 頁的製備) (0.72 g)，緊接著一些第 2 代 Xphos Buchwald 催化劑 (氯(2-二環己基膦基-2',4',6'-三異丙基-1,1'-聯苯基)[2-(2'-胺基-1,1'-聯苯基)]鈀(II)，CAS：1310584-14-5，0.070 g)。將該懸浮液用氬氣脫氣持續 5 分鐘然後在微波中在 110°C 下加熱持續 15 分鐘。將反應混合物冷卻至 0-5°C 並且用 HCl 2 M 酸化。將該混合物用二氯甲烷萃取 3 次，將合併的有機層用 MgSO₄ 乾燥、過濾並且蒸發以給出粗殘餘物，將該粗殘餘物吸收在 isolate 上並且藉由使用 0-100% EtOAc/環己烷的層析 (使用 combiflash Rf 機器) 純化以給出一定量的希望的化合物。¹H NMR (400 MHz, 氯仿-*d*) δ ppm 3.87 (s, 3 H) 7.08 (d, *J*=5.14 Hz, 1 H) 7.16 (s, 1 H) 7.58 (d, *J*=5.13 Hz, 1 H) 7.94 (s, 1 H) 8.06 - 8.15 (m, 1 H)

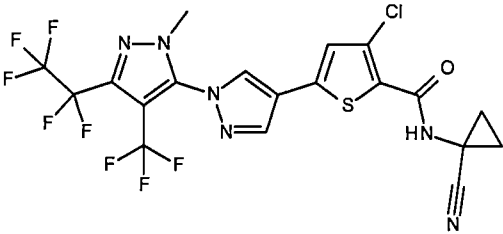
步驟 C：3-氯-N-環丙基-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-2-甲醯胺的製備



【0118】 向 3-氯-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-2-甲酸 (0.090 g) 在二氯甲烷 (2.7 mL) 中的溶液中，加入環丙胺 (0.012 g)、*N*-乙基-*N'*-(3-二甲基胺基丙基)碳二亞胺鹽酸鹽 (0.039 g) 和 1-羥基-7-氮雜苯並三唑 (0.027 g)。向這種懸浮液中，然後加入三乙胺 (0.077 mL, 0.55 mmol) 並且將黃色溶液在室溫下攪拌持續 4 小時。將反應混合物然後在乙酸乙酯與水之間萃取兩次。將合併的有機層用 MgSO₄ 乾燥、過濾並且蒸發以給出粗殘餘物，將該粗殘餘物吸收在 isolate 上並且

藉由使用 0-100% EtOAc/環己烷的層析（使用 combiflash Rf 機器）純化以給出 27 mg 的希望化合物。¹H NMR (400 MHz, 氯仿-*d*) δ ppm 0.68 (dt, *J*=3.5, 1.6 Hz, 2 H) 0.84 - 0.96 (m, 2 H) 2.93 (m, *J*=3.3 Hz, 1 H) 3.86 (s, 3 H) 7.05 (s, 2 H) 7.89 (s, 1 H) 8.00 - 8.09 (m, 1 H)。

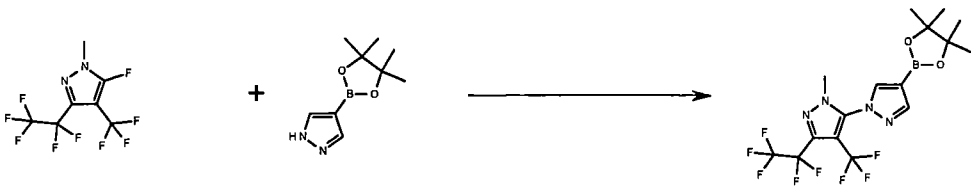
化合物 3-氯-N-(1-氰基環丙基)-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-2-甲醯胺（表 1 中的化合物 1）以與化合物 2 類似的方式製備：



¹H NMR (400 MHz, 氯仿-*d*) δ ppm 1.35 - 1.48 (m, 3 H) 1.65 - 1.73 (m, 2 H) 3.86 (s, 3 H) 7.08 (s, 1 H) 7.41 (s, 1 H) 7.92 (s, 1 H) 8.07 (s, 1 H)

實施例 3 和 4：2-氯-N-(1-氰基環丙基)-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-3-甲醯胺（實施例 4）和 2-氯-N-環丙基-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-3-甲醯胺（實施例 3）

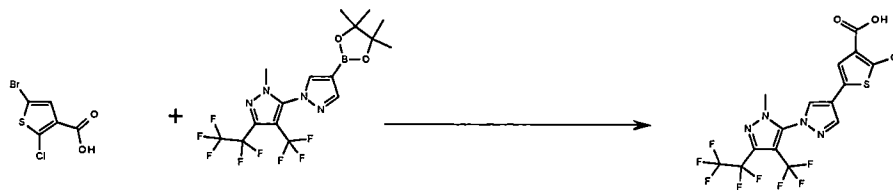
步驟 A：1-甲基-3-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-5-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜環戊硼烷-2-基)吡唑-1-基]-4-(三氟甲基)吡唑的製備



【0119】 向 4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜環戊硼烷-2-基)-1H-吡唑

(2.55 g) 在乙腈 (89.3 mL) 中的溶液中加入碳酸銨 (8.40 g) 和 5-氟-1-甲基-3-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑 (3.65 g, 描述於文獻 WO 2014012975 中的製備)。將懸浮液然後加熱至 80°C 持續 2.5 個小時, 然後使其在室溫下靜置過夜。然後將反應混合物在乙酸乙酯與水之間萃取兩次。將合併的有機層用 MgSO_4 乾燥、過濾並且蒸發以給出粗殘餘物, 將該粗殘餘物吸收在 isolate 上並且藉由使用 0-100% EtOAc/環己烷的層析 (使用 combiflash Rf 機器) 純化以給出 4.91 g 的希望化合物。 ^1H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.36 (s, 12 H) 3.78 (s, 3 H) 7.93 (s, 1 H) 8.04 - 8.17 (m, 1 H)

步驟 B: 2-氯-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-3-甲酸的製備

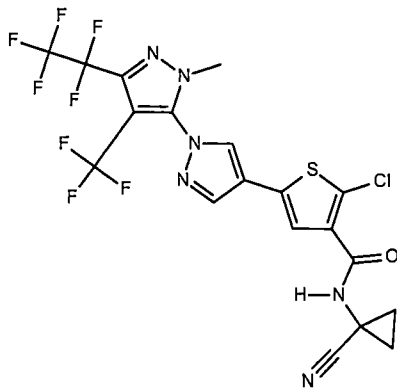


【0120】 向在室溫下攪拌的溶解在 N,N-二甲基甲醯胺 (22 mL) 中的 5-溴-2-氯-噻吩-3-羧酸 (如描述於 US 5840917 中製備的, 0.80 g) 和 1-甲基-3-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-5-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜環戊硼烷-2-基)吡唑-1-基]-4-(三氟甲基)吡唑 (2.3 g) 的溶液中, 加入碳酸鉀 (1.4 g) 並且加入水 (4.0 mL)。將反應在氬氣下脫氣持續 10 分鐘, 然後加入四(三苯基磷)鈰 (0) (0.39 g)。將反應混合物在 60°C 下攪拌持續 6 小時, 然後將反應倒入 50 ml 水並且用 HCl 2 M 酸化至 pH 約 2。將混合物在乙酸乙酯與水之間萃取兩次。將合併的有機層乾燥 (MgSO_4)、過濾並且蒸發以給出粗殘餘物, 將該粗殘餘物吸收在 isolate 上並且藉由使用 0-100% EtOAc/環己烷的層析 (使用

combiflash Rf 機器) 純化以給出 1.21 g 的含有希望的化合物的混合物。將殘餘物用 10 ml 戊烷研磨並攪拌持續 10 分鐘。將溶劑傾析出，加入更多戊烷 (10 ml) 並且將懸浮液攪拌另外 5 分鐘。將固體過濾並且在真空下乾燥以給出 926 mg 的希望的化合物。¹H NMR (400 MHz, 氯仿-*d*) δ ppm 3.86 (s, 3 H) 7.49 (s, 1 H) 7.83 (s, 1 H) 8.03 (s, 1 H)。

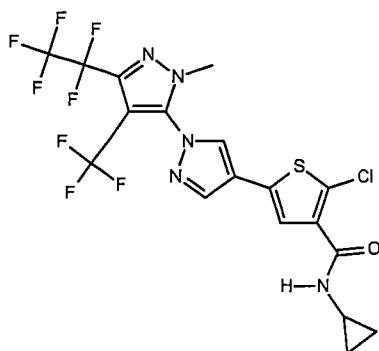
步驟 C：

2-氯-N-(1-氰基環丙基)-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-3-甲醯胺 (實施例 4) 以與化合物 A02 類似的方式在從 2-氯-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-3-甲酸的製備實施例 1 的步驟 C 中製備。



¹H NMR (400 MHz, 氯仿-*d*) δ ppm 1.33 - 1.48 (m, 2 H) 1.64 - 1.74 (m, 2 H) 3.86 (s, 3 H) 7.06 (s, 1 H) 7.51 (s, 1 H) 7.82 (s, 1 H) 7.97 - 8.06 (m, 1 H)。

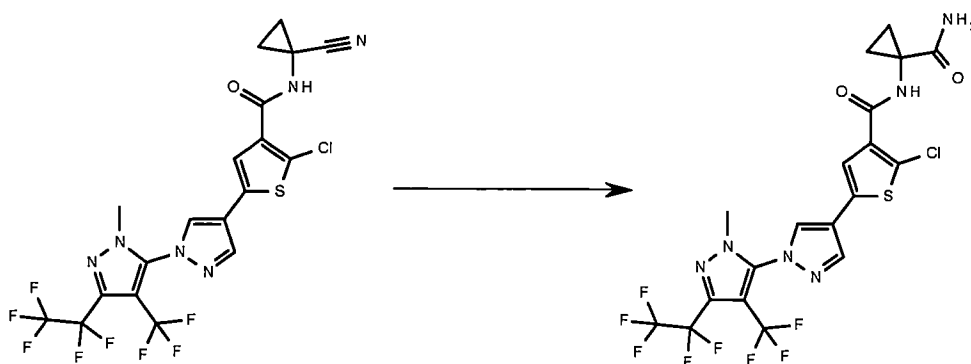
2-氯-N-環丙基-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-3-甲醯胺 (實施例 3) 以與化合物 A02 類似的方式在從 2-氯-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-3-甲酸的製備實施例 1 的步驟 C 中製備。



^1H NMR (400 MHz, 氯仿-*d*) δ ppm 0.58 - 0.73 (m, 2 H) 0.83 - 0.96 (m, 2 H) 2.91 (dd, $J=7.15, 3.85$ Hz, 1 H) 3.85 (s, 3 H) 6.63 (br. s., 1 H) 7.48 (s, 1 H) 7.80 (s, 1 H) 7.96 - 8.04 (m, 1 H)。

實施例 5 和 6：

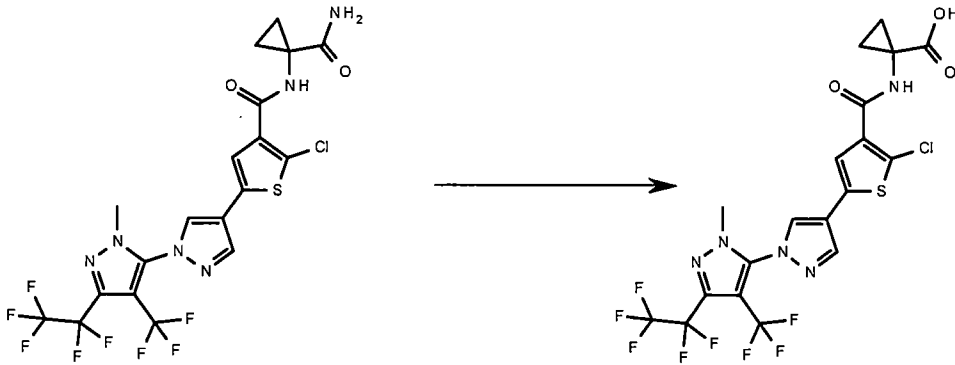
步驟 A：N-(1-氨基甲酰基環丙基)-2-氯-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-3-甲酰胺的製備（實施例 5）



【0121】 將 2-氯-N-(1-氰基環丙基)-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-3-甲酰胺 (0.100 g) 在二甲基亞碲 (0.805 mL) 中的溶液用碳酸鉀 (0.0173 g) 處理並且然後冷卻至 0-5°C。然後向該溶液中加入過氧化氫 35% (0.126 mL) 並使黃色溶液升溫至室溫並攪拌 17 小時。然後將混合物在乙酸乙酯與水之間萃取兩次。將合併的有機層用 MgSO_4 乾燥、過濾並且蒸發以給出粗殘餘物，將該粗殘餘物在 2 mL 的戊烷中研磨並且然後將該懸浮液攪拌 15 min。將固體過濾，用 1 mL 的戊烷洗

滌兩次，然後在真空下乾燥以給出 90 mg 的白色固體。將該固體懸浮在 5 mL 的二乙醚中並且攪拌 1 小時。將懸浮液過濾，將固體用 1 mL 的二乙醚和 2 x 2 mL 的戊烷洗滌；然後將固體在真空下乾燥以給出 77 mg 的希望化合物 N-(1-胺基甲醯基環丙基)-2-氯-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-3-甲醯胺。¹H NMR (400 MHz, 氯仿-*d*) δ ppm 1.12 - 1.25 (m, 2 H) 1.68 - 1.84 (m, 2 H) 3.86 (s, 3 H) 5.35 - 5.68 (m, 1 H) 6.28 - 6.58 (m, 1 H) 7.10 (s, 1 H) 7.49 (s, 1 H) 7.83 (s, 1 H) 8.01 (s, 1 H)

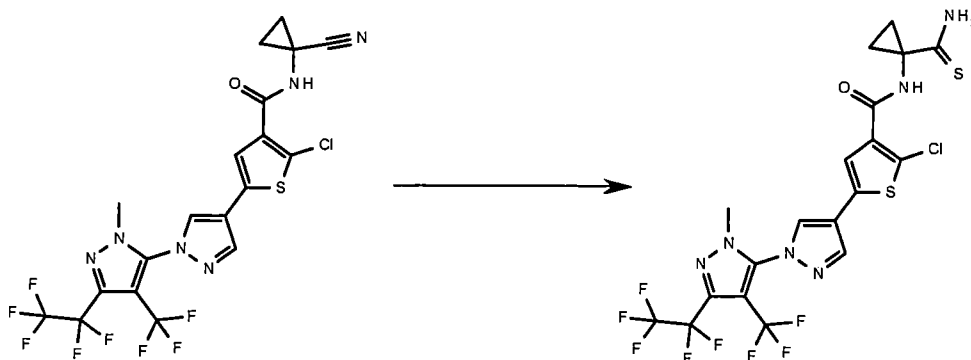
步驟 B：1-[[2-氯-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-3-羰基]胺基]環丙烷甲酸的製備



【0122】 將 N-(1-胺基甲醯基環丙基)-2-氯-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-3-甲醯胺 (0.057 g) 在硫酸 72% (0.99 mL) 中的溶液在 85°C 下加熱持續 7.5 小時。然後將反應混合物冷卻至 0-5°C 並且小心地用水稀釋。將該混合物在二氯甲烷與水之間萃取兩次，將合併的有機層用 MgSO₄ 乾燥、過濾並且蒸發以給出粗殘餘物，將該粗殘餘物吸收在 isolate 上並且藉由使用 0-40% EtOAc/環己烷的層析 (使用 combiflash Rf 機器) 純化以給出 45 mg 的希望化合物。¹H NMR (400 MHz, 氯仿-*d*) δ ppm 1.32 - 1.48 (m, 2 H) 1.69 - 1.88 (m, 2 H) 3.85 (s, 3 H) 7.06 (s, 1 H)

7.43 - 7.54 (m, 1 H) 7.76 - 7.87 (m, 1 H) 7.95 - 8.06 (m, 1 H)

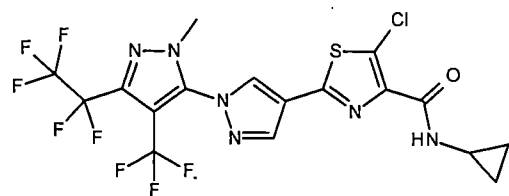
步驟 C：N-(1-胺基硫代甲鹽基環丙基)-2-氯-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-3-甲鹽胺的製備（實施例 6）



【0123】 向 2-氯-N-(1-氰基環丙基)-5-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻吩-3-甲鹽胺(0.15 g)在甲醇(1.6 mL)中的溶液中加入硫化銨(0.15 g)並且將該反應加熱到回流 3 小時。將反應混合物然後冷卻至室溫，將混合物在乙酸乙酯與水之間萃取兩次。將合併的有機層用 MgSO₄ 乾燥、過濾並且在真空下蒸發以給出粗殘餘物，將該粗殘餘物吸收在 isolate 上並且藉由使用 0-100% EtOAc/環己烷的層析（使用 combiflash Rf 機器）純化以給出 68 mg 的希望化合物。

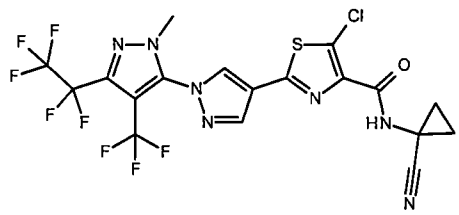
¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 1.09 - 1.31 (m, 3 H) 1.68 - 1.90 (m, 2 H) 2.50 (br. s., 25 H) 3.81 (s, 4 H) 7.65 (s, 1 H) 8.31 (s, 1 H) 8.65 (s, 1 H) 8.78 (s, 1 H) 9.02 (br. s., 1 H) 9.64 (br. s., 1 H)

實施例 7 和 8：



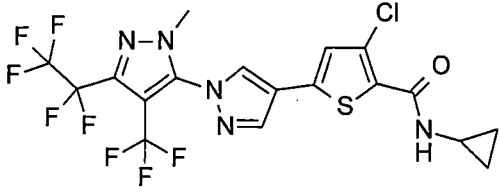
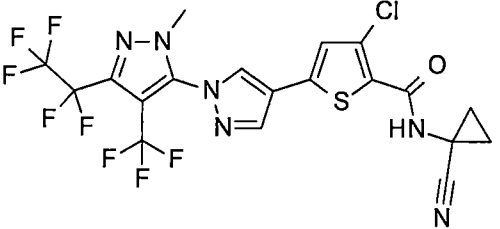
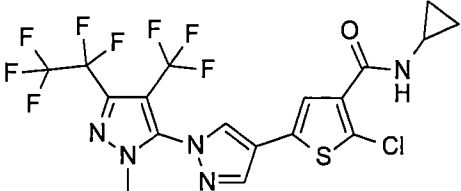
【0124】 5-氯-N-環丙基-2-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲

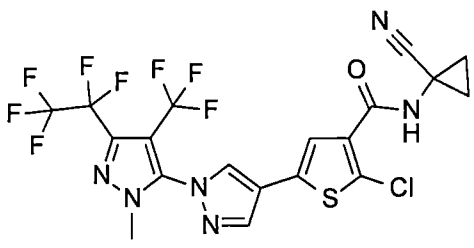
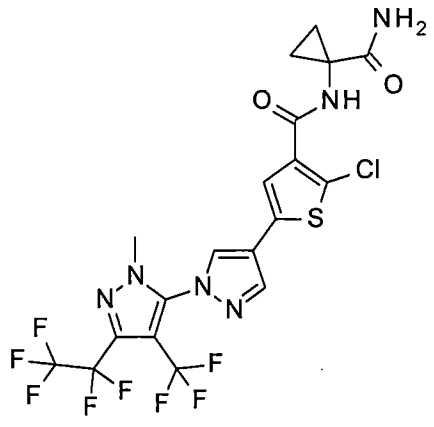
基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻唑-4-甲醯胺 (實施例 8) 係以與如對於實施例 3 和 4 給出的步驟 B 和 C 類似的方式製備的。¹H NMR (400 MHz, 氯仿-*d*) δ ¹H NMR (400 MHz, 氯仿-*d*) δ ppm 0.59 - 0.73 (m, 2 H) 0.82 - 0.94 (m, 2 H) 2.91 (td, *J*=7.24, 3.48 Hz, 1 H) 3.86 (s, 3 H) 7.36 (br. s., 1 H) 8.12 (s, 1 H) 8.18 - 8.28 (m, 1 H)。

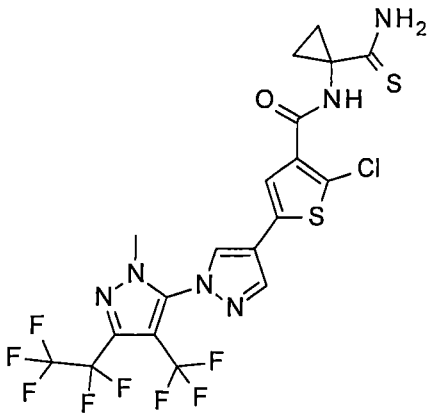
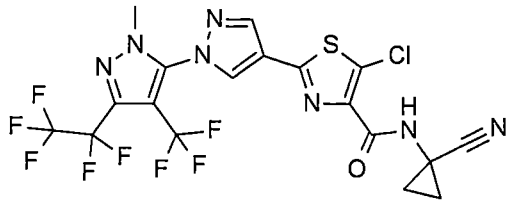
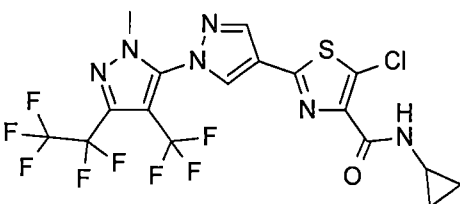


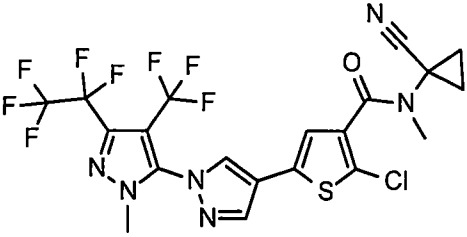
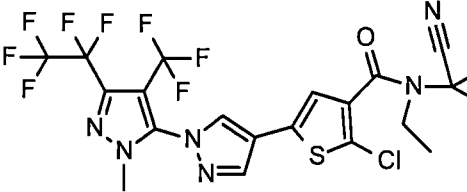
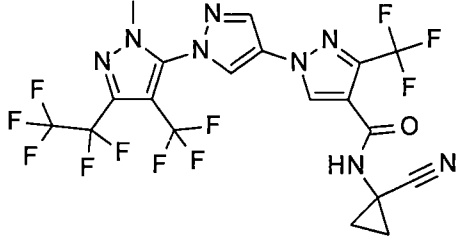
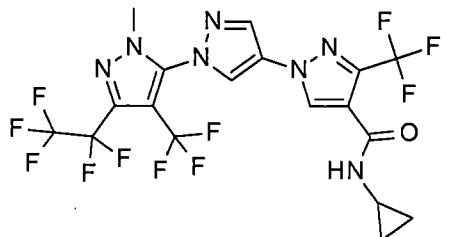
5-氯-N-(1-氰基環丙基)-2-[1-[2-甲基-5-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-4-(三氟甲基)吡唑-3-基]吡唑-4-基]噻唑-4-甲醯胺 (實施例 7) 係以與在製備實施例 2 中的步驟 B 和 C 類似的方式製備的。¹H NMR (400 MHz, 氯仿-*d*) δ ppm 1.38 - 1.50 (m, 2 H) 1.66 - 1.77 (m, 3 H) 3.90 (s, 3 H) 7.79 (s, 1 H) 8.08 - 8.22 (m, 1 H) 8.22 - 8.31 (m, 1 H)。

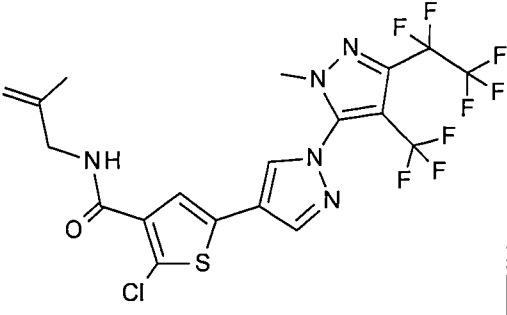
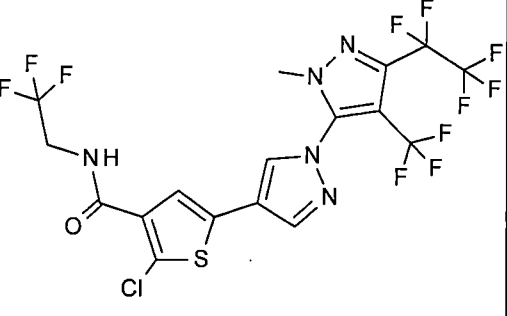
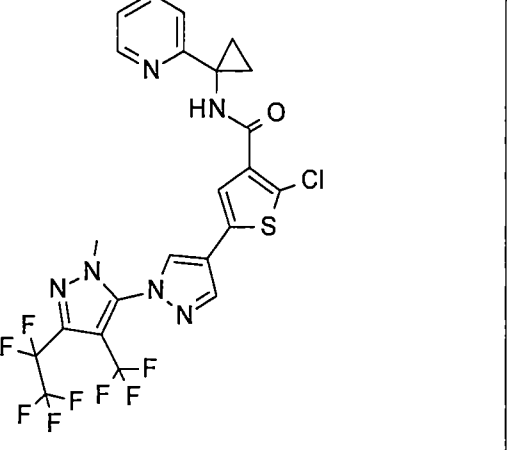
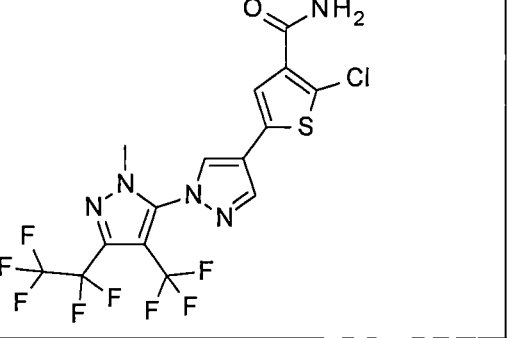
表 1：這係製備的實施例化合物的清單。化合物 9-70 已經以與實施例 1 至 8 類似的方式製備。它們可以根據在此揭露的流程 1-4 或根據已知的方法製備。

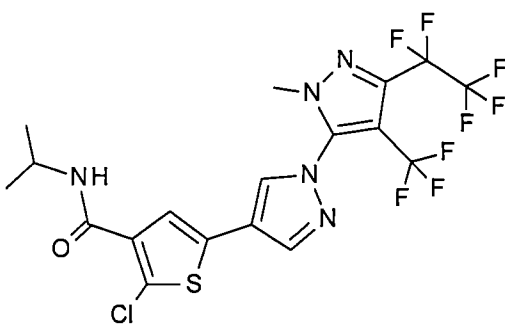
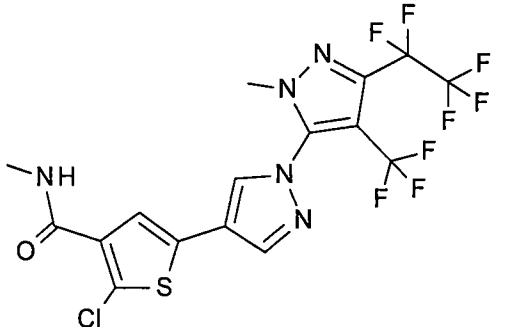
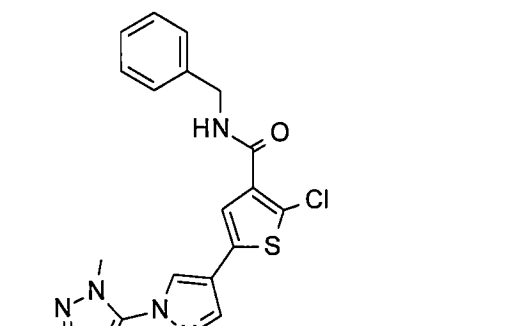
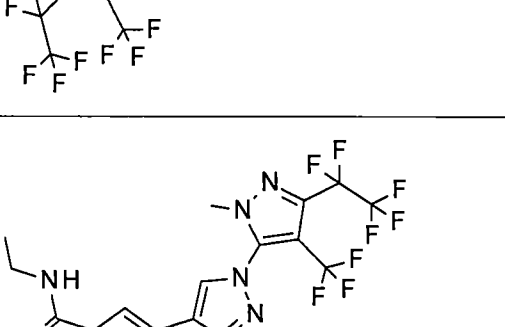
Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
1		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 0.68 (dt, <i>J</i> =3.5, 1.6 Hz, 2 H) 0.84 - 0.96 (m, 2 H) 2.93 (m, <i>J</i> =3.3 Hz, 1 H) 3.86 (s, 3 H) 7.05 (s, 2 H) 7.89 (s, 1 H) 8.00 - 8.09 (m, 1 H)	
2		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 1.35 - 1.48 (m, 3 H) 1.65 - 1.73 (m, 2 H) 3.86 (s, 3 H) 7.08 (s, 1 H) 7.41 (s, 1 H) 7.92 (s, 1 H) 8.07 (s, 1 H)	
3		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 0.58 - 0.73 (m, 2 H) 0.83 - 0.96 (m, 2 H) 2.91 (dd, <i>J</i> =7.15, 3.85 Hz, 1 H) 3.85 (s, 3 H) 6.63 (br. s., 1	

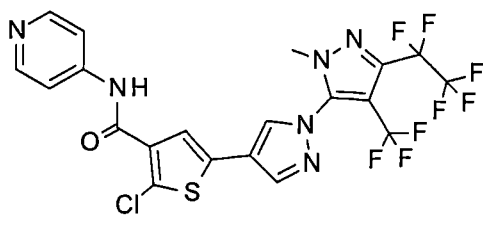
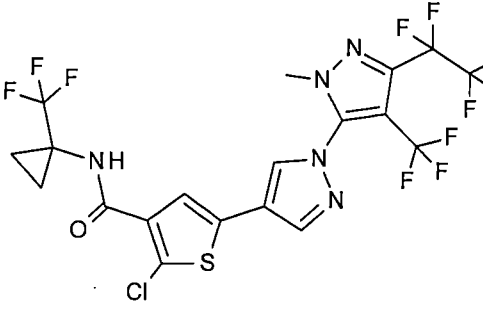
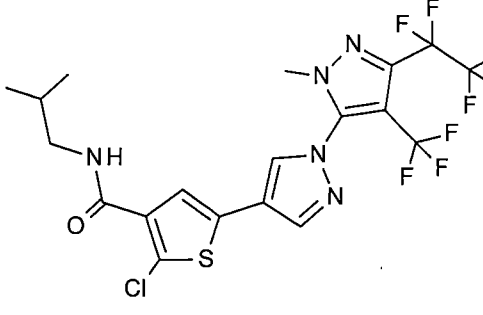
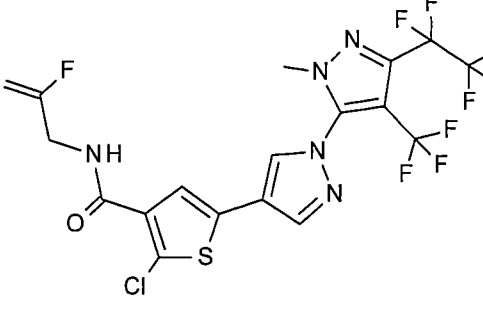
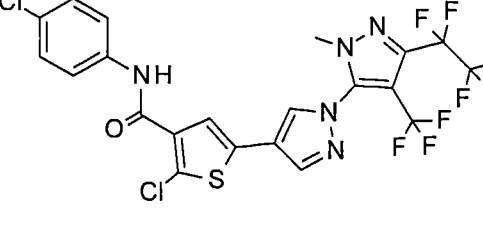
Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
		H) 7.48 (s, 1 H) 7.80 (s, 1 H) 7.96 - 8.04 (m, 1 H)	
4		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 1.33 - 1.48 (m, 2 H) 1.64 - 1.74 (m, 2 H) 3.86 (s, 3 H) 7.06 (s, 1 H) 7.51 (s, 1 H) 7.82 (s, 1 H) 7.97 - 8.06 (m, 1 H)	
5		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 1.12 - 1.25 (m, 2 H) 1.68 - 1.84 (m, 2 H) 3.86 (s, 3 H) 5.35 - 5.68 (m, 1 H) 6.28 - 6.58 (m, 1 H) 7.10 (s, 1 H) 7.49 (s, 1 H) 7.83 (s, 1 H) 8.01 (s, 1 H)	

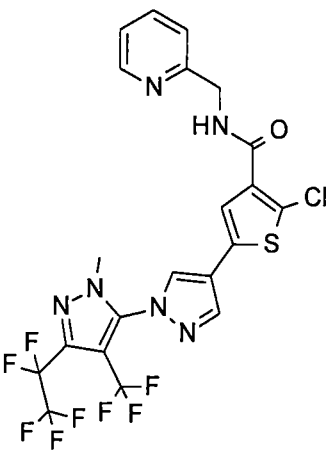
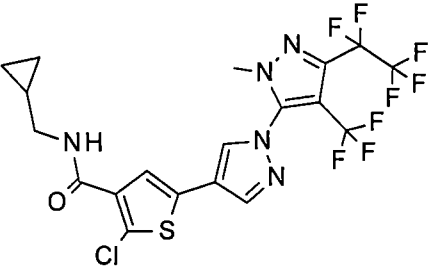
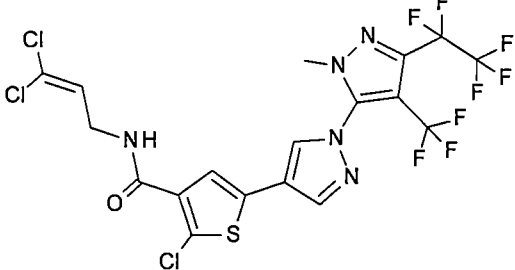
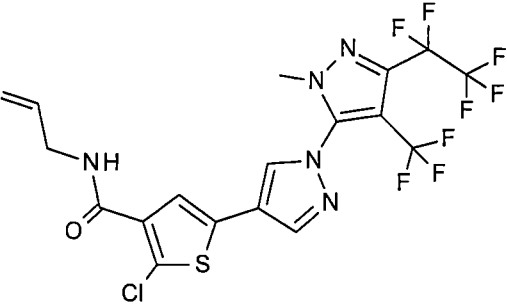
Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
6		¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 1.09 - 1.31 (m, 3 H) 1.68 - 1.90 (m, 2 H) 2.50 (br. s., 25 H) 3.81 (s, 4 H) 7.65 (s, 1 H) 8.31 (s, 1 H) 8.65 (s, 1 H) 8.78 (s, 1 H) 9.02 (br. s., 1 H) 9.64 (br. s., 1 H)	
7		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 1.38 - 1.50 (m, 2 H) 1.66 - 1.77 (m, 3 H) 3.90 (s, 3 H) 7.79 (s, 1 H) 8.08 - 8.22 (m, 1 H) 8.22 - 8.31 (m, 1 H)	
8		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ¹ H NMR (400 MHz, 氯仿- <i>d</i>) δ ppm 0.59 - 0.73 (m, 2 H) 0.82 - 0.94 (m, 2 H) 2.91 (td, <i>J</i> =7.24,	

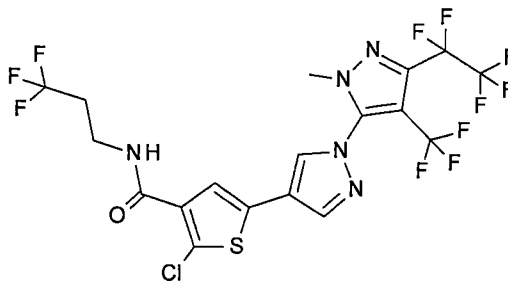
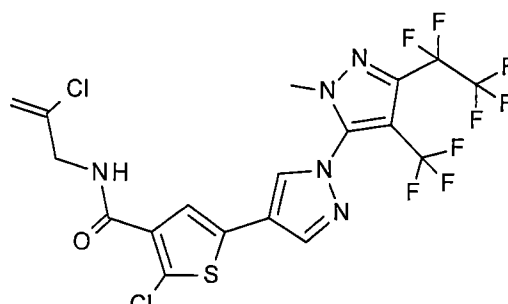
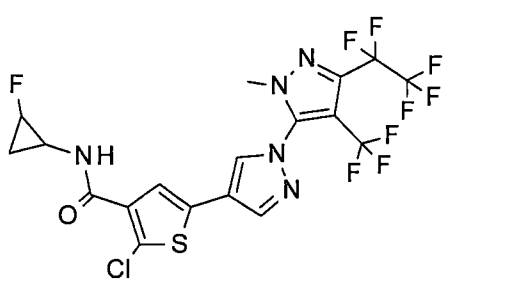
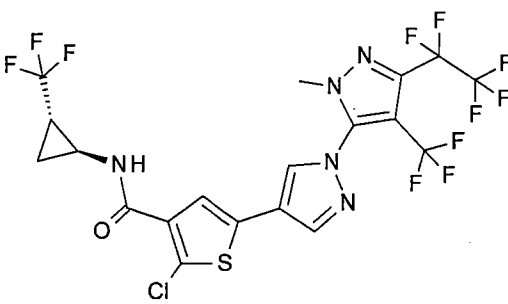
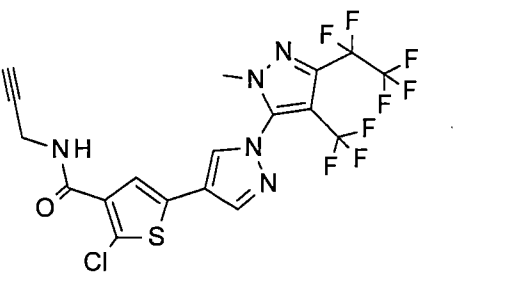
Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
		3.48 Hz, 1 H) 3.86 (s, 3 H) 7.36 (br. s., 1 H) 8.12 (s, 1 H) 8.18 - 8.28 (m, 1 H)	
9		LCMS : 573 (M+H) ⁺ , R _f = 1.23 min (方法 A)	
10		LCMS : 587 (M-H) ⁻ , R _f = 1.26 min (方法 A)	
11		¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ ppm: 1.34 - 1.40 (m, 2 H) 1.65 - 1.73 (m, 2 H) 3.87 (s, 3 H) 6.55 (br s, 1 H) 8.12 (s, 1 H) 8.21 (s, 1 H) 8.42 (s, 1 H)	
12		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm: 0.61 - 0.66 (m, 2 H) 0.88 - 0.93 (m, 2 H) 2.90 (m, 1 H) 3.87 (s, 3 H) 6.21 (br s, 1 H) 8.10 (s, 1 H) 8.20	

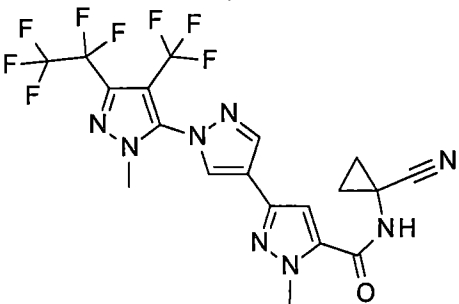
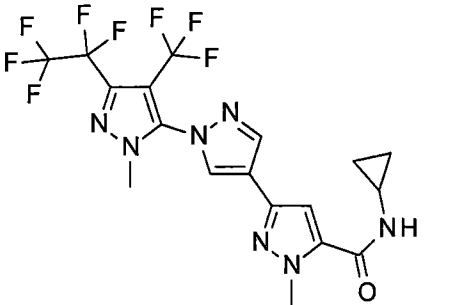
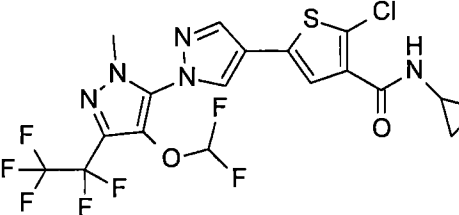
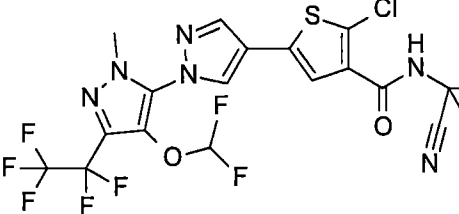
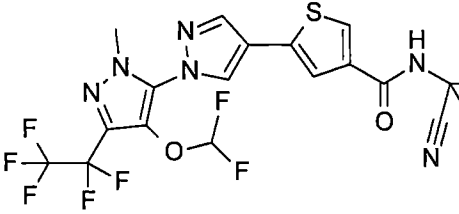
Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
		(s, 1 H) 8.35 (s, 1 H)	
13		LCMS : 548 (M+H) ⁺ , R _f = 2.01 min (方法 C)	
14		LCMS : 576 (M+H) ⁺ , R _f = 1.99 min (方法 C)	
15		LCMS : 611 (M+H) ⁺ , R _f = 1.90 min (方法 C)	
16		LCMS : 494 (M+H) ⁺ , R _f = 1,74 min (方法 C)	

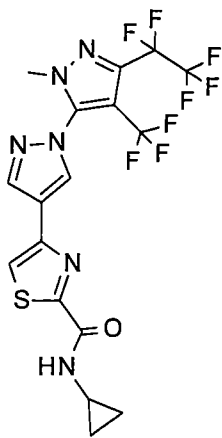
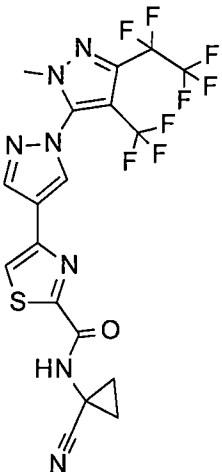
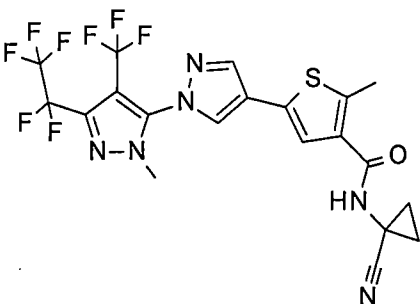
Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
17		LCMS : 536 (M+H) ⁺ , R _f = 1.99 min (方法 C)	
18		LCMS : 508 (M+H) ⁺ , R _f = 1.81 min (方法 C)	
19		LCMS : 584 (M+H) ⁺ , R _f = 2.06 min (方法 C)	
20		LCMS : 522 (M+H) ⁺ , R _f = 1.90 min (方法 C)	

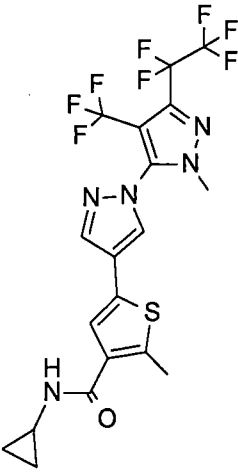
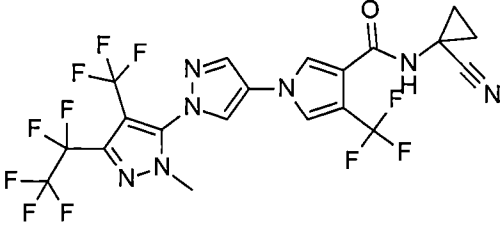
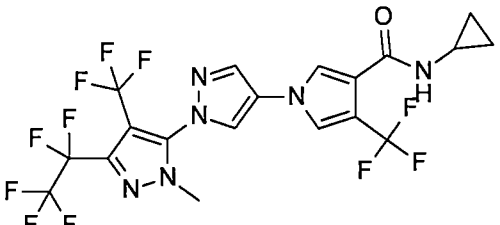
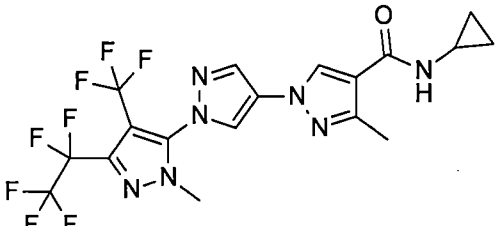
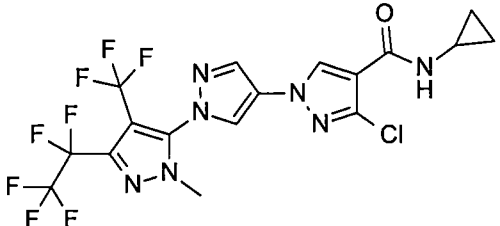
Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
21		LCMS : 571 (M+H) ⁺ , R _f = 1.48 min (方法 C)	
22		LCMS : 602 (M+H) ⁺ , R _f = 2.03 min (方法 C)	
23		LCMS : 550 (M+H) ⁺ , R _f = 2.07 min (方法 C)	
24		LCMS : 552 (M+H) ⁺ , R _f = 1.96 min (方法 C)	
25		LCMS : 604 (M+H) ⁺ , R _f = 2.20 min (方法 C)	

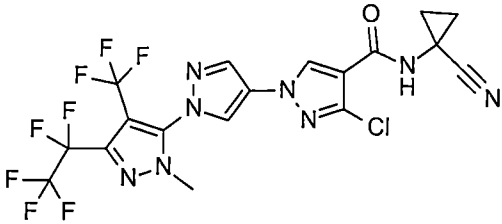
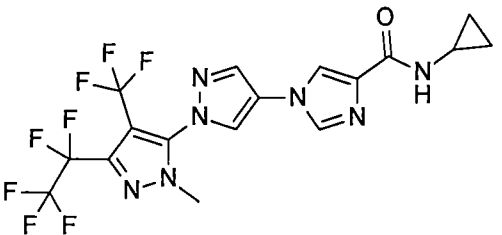
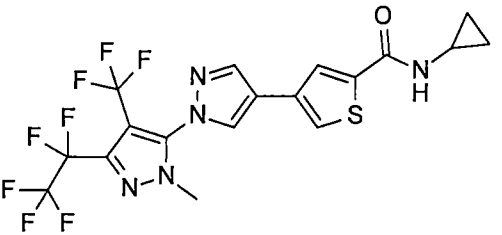
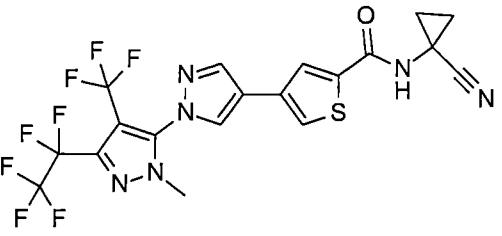
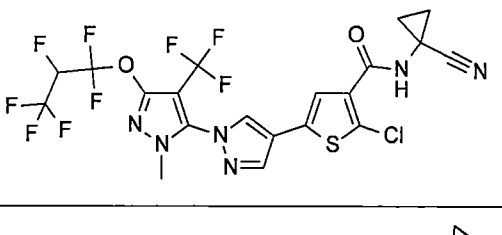
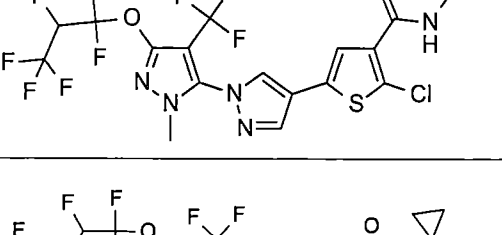
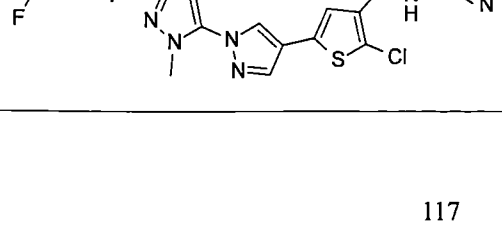
Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
26		LCMS : 585 (M+H) ⁺ , R _f = 1.78 min (方法 C)	
27		LCMS : 548 (M+H) ⁺ , R _f = 2.01 min (方法 C)	
28		LCMS : 602 (M+H) ⁺ , R _f = 2.11 min (方法 C)	
29		LCMS : 534 (M+H) ⁺ , R _f = 1.94 min (方法 C)	

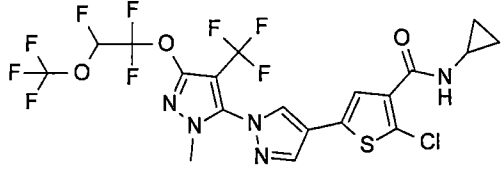
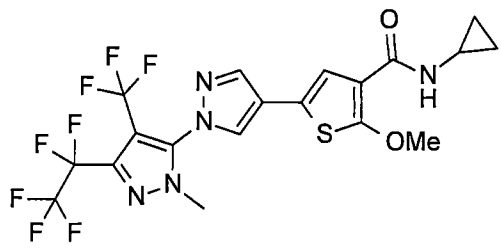
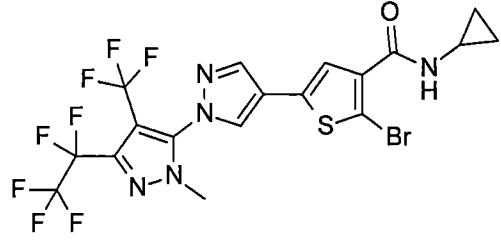
Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
30		LCMS : 590 (M+H) ⁺ , R _f = 2.01 min (方法 C)	
31		LCMS : 568 (M+H) ⁺ , R _f = 2.02 min (方法 C)	
32		LCMS : 552 (M+H) ⁺ , R _f = 1.89 min (方法 C)	
33		LCMS : 602 (M+H) ⁺ , R _f = 2.02 min (方法 C)	
34		LCMS : 532 (M+H) ⁺ , R _f = 2.19 min (方法 C)	

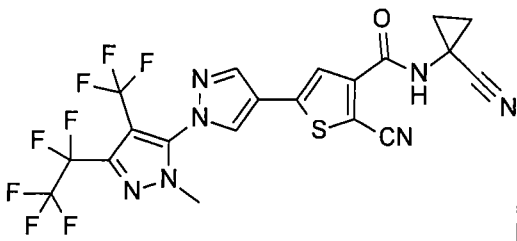
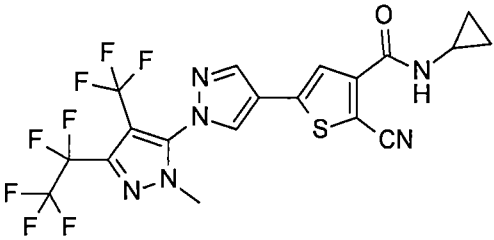
Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
35		LCMS : 523 (M+H) ⁺ , R _f = 1.06 min (方法 A)	
36		LCMS : 498 (M+H) ⁺ , R _f = 1.07 min (方法 A)	156-15 9
37		LCMS : 532 (M+H) ⁺ , R _f = 1.85 min (方法 B)	
38		LCMS : 557 (M+H) ⁺ , R _f = 1.82 min (方法 B)	
39		LCMS : 522 (M+H) ⁺ , R _f = 1.71 min (方法 B)	

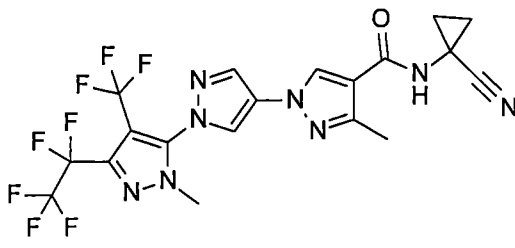
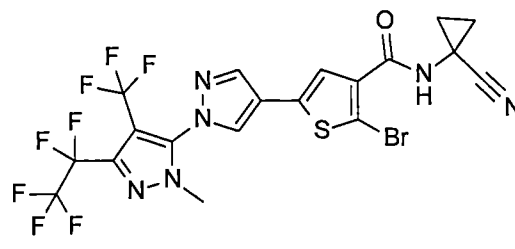
Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
40		LCMS : 501 (M+H) ⁺ , R _f = 1.13 min (方法 A)	86-88
41		LCMS : 526 (M+H) ⁺ , R _f = 1.10 min (方法 A)	84-86
42		LCMS : 539 (M+H) ⁺ , R _f = 1.14 min (方法 A)	204-20 6

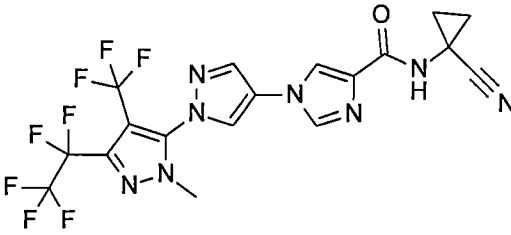
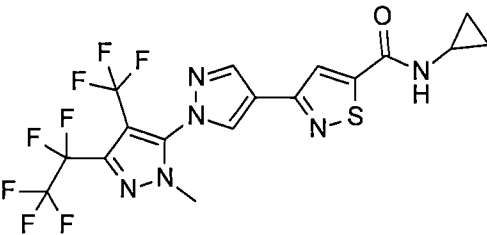
Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
43		LCMS : 514 (M+H) ⁺ , R _f = 1.15 min (方法 A)	164-166
44		LCMS : 576 (M+H) ⁺ , R _f = 1.12 min (方法 A)	125-127
45		LCMS : 551 (M+H) ⁺ , R _f = 1.13 min (方法 A)	150-153
46		LCMS : 498 (M+H) ⁺ , R _f = 1.06 min (方法 A)	168-171
47		LCMS : 518 (M+H) ⁺ , R _f = 1.11 min (方法 A)	183-185

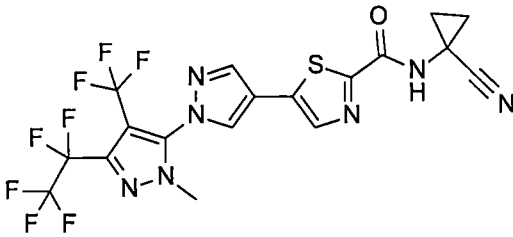
Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
48		LCMS : 543 (M+H) ⁺ , R _f = 1.09 min (方法 A)	194-19 6
49		LCMS : 484 (M+H) ⁺ , R _f = 1.00 min (方法 A)	190-19 1
50		LCMS : 501 (M+H) ⁺ , R _f = 1.10 min (方法 A)	62-63
51		LCMS : 525 (M+H) ⁺ , R _f = 1.09 min (方法 A)	60-61
52		LCMS : 607 (M+H) ⁺ , R _f = 1.13 min (方法 A)	
53		LCMS : 582 (M+H) ⁺ , R _f = 1.15 min (方法 A)	
54		LCMS : 622 (M+H) ⁺ , R _f = 1.15 min (方法 A)	

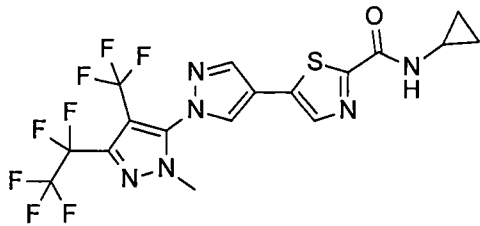
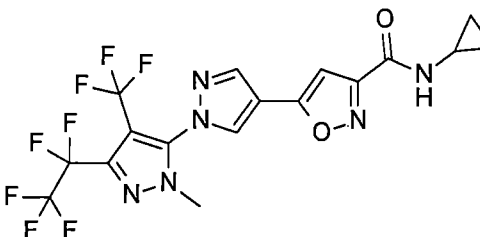
Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
55		LCMS : 598 (M+H) ⁺ , R _f = 1.17 min (方法 A)	
56		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.97 (s, 1H), 7.72 (s, 1H), 7.42 (s, 1H), 6.93 (s, 1H), 4.10 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 2.91 - 2.83 (m, 1H), 0.87 - 0.84 (m, 2H), 0.61 - 0.56 (m, 2H) ° ¹⁹ F NMR (283 MHz, CDCl ₃) δ -61.24 - -61.44 (m , 3F), -88.87 (s,3F), -116.22 - -116.65 (m,2F) °	152-153
57		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.99 (s, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.44 (s, 1H), 6.57 (s, 1H), 3.84 (s, 3H), 2.85-2.95 (m, 1H), 0.95-0.85 (m, 2H), 0.70-0.60(m, 2H) °	192-193

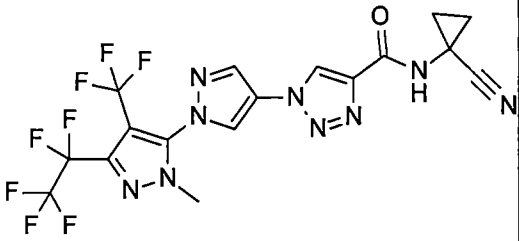
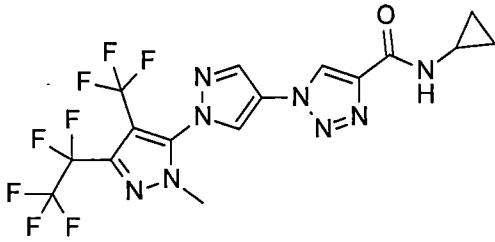
Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
		¹⁹ F NMR (283 MHz, CDCl ₃) δ -60.91 - -61.11 (m,3F), -88.52 (s,3F), -116.03 - -116.25 (m,2F) °	
58		¹ H NMR (400 MHz, cdcl ₃) δ 8.10 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.64 (s, 1H), 6.98 (s, 1H), 3.87 (s, 3H), 1.73-1.67 (m, 2H), 1.47-1.40 (m, 2H) ° ¹⁹ F NMR (283 MHz, CDCl ₃) δ -61.03 - -61.19 (m,3F), -88.65 (s,3F), -116.17 - -116.39 (m,2F) °	185-186
59		¹ H NMR (400 MHz, cdcl ₃) δ 8.08 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.59 (s, 1H), 6.52 (s, 1H), 3.86 (s, 3H), 2.99 - 2.89 (m, 1H), 0.96 - 0.89 (m, 2H), 0.71 (t, <i>J</i> = 4.6 Hz,	171-172

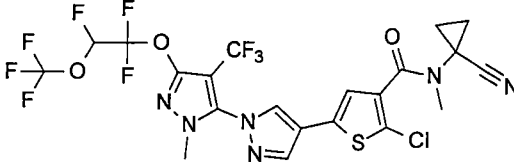
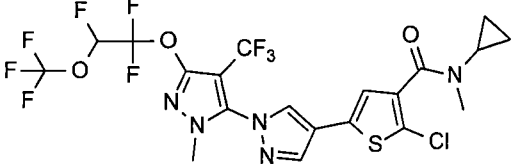
Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
		2H) ° ¹⁹ F NMR (283 MHz, CDCl ₃) δ -60.93 - -61.32 (m,3F), -88.65 (s,3F), -116.07 - -116.53 (m,2F) °	
60		¹ H NMR (400 MHz, cdcl ₃) δ 8.12 (s, 1H), 8.10 (s, 1H), 8.01 (s, 1H), 6.38 (s, 1H), 3.85 (s, 3H), 2.53 (s, 3H), 1.36 (t, <i>J</i> = 6.7 Hz, 2H), 1.30 - 1.20 (m, 2H) ° ¹⁹ F NMR (283 MHz, CDCl ₃) δ -61.01 - -61.08 (t, <i>J</i> = 10.0 Hz,3F), -88.50 (s,3F), -116.07 - -116.17 (dd, <i>J</i> = 20.1, 9.7 Hz,2F) °	209-210
61		¹ H NMR (400 MHz, cdcl ₃) δ 8.00 (s, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.02 (s, 1H),	184-185

Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
		1H), 3.85 (s, 3H), 1.75-1.65 (s, 2H), 1.45-1.35 (s, 2H) ° ¹⁹ F NMR (283 MHz, CDCl ₃) δ -61.06 - -61.30 (m,3F), -88.73 (s,3F), -116.22 - -116.41 (m,2F) °	
62		¹ HNMR (400 MHz, CDCl ₃): δ (ppm) 8.11 (m,3H), 7.89(s,1H), 7.85 (s,1H), 3.86 (s,3H), 1.58 (m,2H),1.37 (m,2H) ° ¹⁹ F NMR (400 MHz, CDCl ₃): δ (ppm) -61.11 (s,3F) ,-88.64 (s,3F) -116.28 (s,2F) °	195-19 7
63		¹ HNMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆): δ (ppm) 9.26 (s, 1H), 8.72 (s, 1H), 8.62 (d, 1H), 8.34 (s, 1H),3.75 (s,	146-14 8

Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
		3H), 2.79-2.80 (m, 1H), 0.64-0.67 (m, 2H), 0.49-0.52 (m, 2H) ° ¹⁹ F NMR (300 MHz, DMSO-d ₆): δ (ppm) -114.30 - 114.40 (m, 2F), -87.33 (s, 3F), -60.22 (s, 3F) °	
64		¹ H NMR (400 MHz, cdcl ₃) δ 8.10 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.69 (s, 1H), 3.86 (s, 3H), 1.68 (dd, <i>J</i> = 8.3, 5.9 Hz, 2H), 1.44 (dd, <i>J</i> = 8.4, 5.9 Hz, 2H) ° ¹⁹ F NMR (283 MHz, CDCl ₃) δ -60.99 - -61.22 (m,3F), -88.65 (s,3F), -116.13 - -116.45 (m,2F) °	158-159

Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
65		¹ H NMR (400 MHz, cdcl ₃) δ 8.08 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.29 (s, 1H), 3.86 (s, 3H), 2.98 - 2.87 (m, 1H), 0.94 - 0.85 (m, 2H), 0.75 - 0.64 (m, 2H) ° ¹⁹ F NMR (283 MHz, CDCl ₃) δ -60.88 - -61.12 (m,3F), -88.54 (s,3F), -115.94 - -116.43 (m,2F) °	132-133
66		¹ HNMR (400MHz, CDCl ₃): δ (ppm) 8.19(s,1H),8.10(s,1H), 6.88 (br,1H), 6.86 (s,1H), 3.85 (s,3H), 2.90 (m,1H), 0.89 (m,2H), 0.68 (m,2H) ¹⁹ F NMR (400 MHz, CDCl ₃): δ (ppm) -61.19	181-183

Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
		(s,3F), -88.64 (s,3F) -116.25 (s,2F) °	
67		¹ HNMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆): δ (ppm) 9.69 (s,1H), 9.31 (s,1H), 9.05 (s,1H), 8.65 (s,1H), 3.81 (s,3H), 1.54 (m,2H), 131 (m,2H), ¹⁹ F NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆): δ (ppm) -60.18 (s, 3F), -87.26 (s, 3F), -114.35 (s, 2F) °	>250
68		¹ HNMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆): δ (ppm) 9.19 (s,1H), 9.03 (s,1H), 8.69 (br,1H), 8.63 (s,1H), 3.81 (s,3H), 2.85 (m,1H), 1.20 (m,2H), 0.66 (m,2H) ¹⁹ F NMR (400 MHz,	242-24 4

Ex. 編號	結構	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , δ ppm LC MS	Mp (°C)
		DMSO-d ₆ : δ (ppm) -60.20 (s,3F), -87.26 (s,3F) -114.36 (s,2F) °	
69		LCMS : 637 (M+H) ⁺ , R _f = 1.20 min (方法 A)	
70		LCMS : 612 (M+H) ⁺ , R _f = 1.22 min (方法 A)	

配製物實施例 (% = 重量百分比)

實施例 F1：乳液濃縮物	a)	b)	c)
活性成分	25%	40%	50%
十二烷基苯磺酸鈣	5%	8%	6%
蓖麻油聚乙烯			
乙二醇醚 (36 mol 的 EO)	5%	-	-
三丁基苯氧基聚乙二醇			
醚 (30 mol 的 EO)	-	12%	4%
環己酮	-	15%	20%
二甲苯混合物	65%	25%	20%

可以從該等濃縮物藉由用水稀釋來製備任何所希望濃度的乳液。

實施例 F2：溶液	a)	b)	c)	d)
-----------	----	----	----	----

活性成分	80%	10%	5%	95%
乙二醇單甲醚	20%	-	-	-
聚乙二醇				
MW 400	-	70%	-	-
N-甲基吡咯啉-2-酮	-	20%	-	-
環氧化椰子油	-	-	1%	5%
石油醚				
(沸程：160°-190°)	-	-	94%	-

該等溶液適合以微滴的形式使用。

實施例 F3：顆粒	a)	b)	c)	d)
活性成分	5%	10%	8%	21%
高嶺土	94%	-	79%	54%
高度分散的二氧化矽	1%	-	13%	7%
凹凸棒石	-	90%	-	18%

將該活性成分溶解於二氯甲烷中，將該溶液噴霧在一種或多種載體上並且隨後將溶劑在真空下進行蒸發。

實施例 F4：塵劑	a)	b)
活性成分	2%	5%
高度分散的二氧化矽	1%	5%
滑石	97%	-
高嶺土	-	90%

藉由將載體與活性成分密切混合獲得即用型塵劑。

實施例 F5：可濕性粉劑	a)	b)	c)
活性成分	25%	50%	75%
木質素磺酸鈉	5%	5%	-
月桂基硫酸鈉	3%	-	5%
二異丁基-			
萘磺酸鈉	-	6%	10%
辛基苯氧基聚乙二醇			
醚（7-8 mol 的 EO）	-	2%	-
高度分散的二氧化矽	5%	10%	10%
高嶺土	62%	27%	-

將活性成分與添加劑混合並且在合適的研磨機中充分地研磨該混合物。這給出了可濕性粉劑，該等可濕性粉劑可以用水進行稀釋以給出任意的所希望的濃度的懸浮液。

實施例 F6：擠出機顆粒

活性成分	10%
木質素磺酸鈉	2%
羧甲基纖維素	1%
高嶺土	87%

將活性成分與添加劑混合，並且研磨該混合物，用水濕潤，擠出，粒化並在空氣流中乾燥。

實施例 F7：包衣顆粒

活性成分	3%
------	----

聚乙二醇（MW 200）	3%
高嶺土	94%

在混合器中，將精細研磨的活性成分均勻地施用到已經用聚乙二醇濕潤的高嶺土上。這給出了無塵的包衣顆粒。

實施例 F8：懸浮液濃縮物

活性成分	40%
乙二醇	10%
壬基苯氧基聚乙二醇醚（15 mol 的 EO）	6%
木質素磺酸鈉	10%
羧甲基纖維素	1%
37% 甲醛水溶液	0.2%
有機矽油（75% 水性乳液）	0.8%
水	32%

將精細研磨的活性成分與添加劑密切混合。可以從這樣得到的懸浮液濃縮物藉由用水稀釋來製備任何希望濃度的懸浮液。

實施例 F9：乾種子處理用的粉劑	a)	b)	c)
活性成分	25%	50%	75%
輕質礦物油	5%	5%	5%
高度分散的矽酸	5%	5%	-
高嶺土	65%	40%	-
滑石	-	-	20%

將該組合與該等佐劑充分混合並且將混合物在適當的研磨機中充分研

磨，從而獲得了可以直接用於種子處理的粉末。

實施例 F10：可乳化性濃縮物

活性成分	10%
辛酚聚乙二醇醚	3%
(4-5 mol 環氧乙烷)	
十二烷基苯磺酸鈣	3%
蓖麻油聚乙二醇醚 (35 mol 環氧乙烷)	4%
環己酮	30%
二甲苯混合物	50%

在植物保護中可以使用的具有任何所要求的稀釋的乳液可以藉由用水稀釋從這種濃縮物中獲得。

實施例 F11：種子處理用的可流動性濃縮物

活性成分	40%
丙二醇	5%
共聚物丁醇 PO/EO	2%
三苯乙炔酚，具有 10-20 莫耳 EO	2%
1,2-苯並異噻唑啉-3-酮 (處於在水中 20%的溶液形式)	0.5%
單偶氮-顏料鈣鹽	5%
矽油 (處於在水中 75%的乳液的形式)	0.2%
水	45.3%

【0125】 將這種精細研磨的組合與該等佐劑緊密地混合，從而給出了懸浮液濃縮物，可以使用水稀釋從該濃縮物獲得任何所希望的懸浮液。使

用此類稀釋體，可以對活的植物連同植物繁殖材料進行處理並且對其針對微生物侵染藉由噴霧、傾倒或浸漬進行保護。

【0126】 藉由添加其他有殺昆蟲、殺蟎和/或殺真菌活性的成分，根據本發明的該等組成物的活性可以顯著地加寬，並且適合於當時的環境。根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物與其他具有殺昆蟲、殺蟎和/或殺真菌活性的成分的混合物還可以具有進一步地、出人意料的優點，該等優點還可以在更寬的含義上描述為協同活性。例如，植物對其更好的耐受性、降低的植物毒性，昆蟲可以在它們的不同發育階段得到控制或者在它們的生產期間（例如，在研磨或者混合過程中，在它們的儲藏或它們的使用過程中）更好的行為。

【0127】 在這裡，合適的活性成分的添加物係例如下面類別的活性成分的代表物：有機磷化合物、硝基苯酚衍生物、硫脲、保幼激素、甲脒、二苯甲酮衍生物、脲類、吡咯衍生物、胺基甲酸酯、擬除蟲菊酯、氯化烴、醯基脲、吡啶基亞甲基胺基衍生物、大環內酯類、新菸鹼以及蘇雲金芽孢桿菌製劑。

【0128】 以下根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物與活性成分的混合物係較佳的（縮寫“TX”意為“選自根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物、較佳的是選自實施方式 69 的化合物）：

佐劑，該佐劑選自由以下物質組成的組：石油（替代名稱）(628) + TX，

殺蟎劑，該殺蟎劑選自由以下物質組成的組：1,1-二(4-氯苯基)-2-乙氧基乙醇（IUPAC 名稱）(910) + TX、2,4-二氯苯基苯磺酸酯（IUPAC/化學文摘名稱）(1059) + TX、2-氟-N-甲基-N-1-萘乙醯胺（IUPAC 名稱）(1295) +

TX、4-氯苯基苯基砒 (IUPAC 名稱) (981) + TX、阿巴汀 (1) + TX、滅蟎
 醌 (3) + TX、乙醯蟲脞 [CCN] + TX、氟丙菊酯 (9) + TX、涕滅威 (16) + TX、
 涕滅砒威 (863) + TX、 α -氯氰菊酯 (202) + TX、賽硫磷 (870) + TX、磺
 胺蟎酯 [CCN] + TX、逐磷醯胺 (872) + TX、胺吸磷 (875) + TX、胺吸磷
 草酸氫鹽 (875) + TX、雙甲脒 (24) + TX、殺蟎特 (881) + TX、三氧化二
 砷 (882) + TX、AVI 382 (化合物代碼) + TX、AZ 60541 (化合物代碼) + TX、
 益棉磷 (44) + TX、保棉磷 (45) + TX、偶氮苯 (IUPAC 名稱) (888) + TX、
 三唑錫 (46) + TX、偶氮磷 (889) + TX、奔菌靈 (62) + TX、苯噁磷 (別
 名) [CCN] + TX、苯蟎特 (71) + TX、苯甲酸苄酯 (IUPAC 名稱) [CCN] + TX、
 聯苯肼酯 (74) + TX、氟氯菊酯 (76) + TX、樂殺蟎 (907) + TX、溴滅菊
 酯 (別名) + TX、溴烯殺 (918) + TX、溴硫磷 (920) + TX、乙基溴硫磷
 (921) + TX、溴蟎酯 (94) + TX、噻嗪酮 (99) + TX、丁酮威 (103) + TX、
 丁酮砒威 (104) + TX、丁基噻蟎靈 (別名) + TX、多硫化鈣 (IUPAC 名稱)
 (111) + TX、毒殺芬 (941) + TX、氯滅殺威 (943) + TX、甲萘威 (115)
 + TX、克百威 (118) + TX、三硫磷 (947) + TX、CGA 50' 439 (發展代碼)
 (125) + TX、滅-蟎猛 (126) + TX、殺蟎醚 (959) + TX、殺蟲脒 (964) +
 TX、殺蟲脒鹽酸鹽 (964) + TX、溴蟲脞 (130) + TX、殺蟎醇 (968) + TX、
 殺蟎酯 (970) + TX、敵蟎特 (971) + TX、毒蟲畏 (131) + TX、乙酯殺蟎
 醇 (975) + TX、伊托明 (977) + TX、滅蟲脞 (978) + TX、丙酯殺蟎醇 (983)
 + TX、毒死蜱 (145) + TX、甲基毒死蜱 (146) + TX、蟲蟎磷 (994) + TX、
 瓜菊酯 I (696) + TX、瓜菊酯 II (696) + TX、瓜葉菊素 (696) + TX、四蟎
 嗪 (158) + TX、氯氰碘柳胺 (別名) [CCN] + TX、蠅毒磷 (174) + TX、巴

豆醯甲苯胺(別名)[CCN]+TX、巴毒磷(1010)+TX、硫雜靈(1013)+TX、果蟲磷(1020)+TX、丁氟蟎酯(CAS 登記號:400882-07-7)+TX、高效氯氟氰菊酯(196)+TX、三環錫(199)+TX、氯氰菊酯(201)+TX、DCPM(1032)+TX、DDT(219)+TX、田樂磷(1037)+TX、田樂磷-O(1037)+TX、田樂磷-S(1037)+TX、內吸磷(1038)+TX、內吸磷-甲基(224)+TX、內吸磷-O(1038)+TX、內吸磷-O-甲基(224)+TX、內吸磷-S(1038)+TX、內吸磷-S-甲基(224)+TX、內吸磷-S-甲基磺隆(demeton-S-methylsulphon)(1039)+TX、丁醚脲(226)+TX、氯亞胺硫磷(1042)+TX、二嗪農(227)+TX、抑菌靈(230)+TX、敵敵畏(236)+TX、二克磷(dicliphos)(別名)+TX、三氯殺蟎醇(242)+TX、百治磷(243)+TX、除蟎靈(1071)+TX、甲氟磷(1081)+TX、樂果(262)+TX、二活菌素(別名)(653)+TX、消蟎酚(1089)+TX、消蟎酚(dinex-diclexine)(1089)+TX、消蟎通(269)+TX、敵蟎普(270)+TX、敵蟎普-4[CCN]+TX、敵蟎普-6[CCN]+TX、鄰敵蟎消(1090)+TX、硝戊酯(1092)+TX、硝辛酯殺蟎劑(1097)+TX、硝丁酯(1098)+TX、敵殺磷(1102)+TX、二苯砒(IUPAC 名稱)(1103)+TX、雙硫侖(別名)[CCN]+TX、乙拌磷(278)+TX、DNOC(282)+TX、多芬納普(dofenapyn)(1113)+TX、朵拉菌素(別名)[CCN]+TX、硫丹(294)+TX、因毒磷(1121)+TX、EPN(297)+TX、乙醯胺基阿巴汀(別名)[CCN]+TX、乙硫磷(309)+TX、益硫磷(1134)+TX、乙蟎唑(320)+TX、乙嘧硫磷(1142)+TX、抗蟎唑(1147)+TX、喹蟎醚(328)+TX、苯丁錫(330)+TX、苯硫威(337)+TX、甲氰菊酯(342)+TX、吡蟎胺(別名)+TX、唑蟎-酯(345)+TX、

芬蟎酯 (1157) + TX、芬催凡尼爾 (fentrifanil) (1161) + TX、氰戊菊酯 (349)
 + TX、氟蟲腓 (354) + TX、嘧蟎-酯 (360) + TX、氟佐隆 (1166) + TX、
 氟蟎噻 (1167) + TX、氟蟎脲 (366) + TX、氟氰戊菊酯 (367) + TX、聯氟
 蟎 (1169) + TX、氟蟲脲 (370) + TX、氟氯苯菊酯 (372) + TX、氟殺蟎 (1174)
 + TX、氟胺氰菊酯 (1184) + TX、FMC 1137 (發展代碼) (1185) + TX、伐
 蟲脒 (405) + TX、伐蟲脒鹽酸鹽 (405) + TX、安果 (1192) + TX、胺甲威
 (1193) + TX、 γ -六氯環己烷 (430) + TX、果綠定 (1205) + TX、苧蟎醚
 (424) + TX、庚烯磷 (432) + TX、十六環丙烷 (IUPAC/化學文摘名稱) (1216)
 + TX、噻蟎酮 (441) + TX、碘甲烷 (IUPAC 名稱) (542) + TX、水胺硫磷
 (別名) (473) + TX、異丙基 O-(甲氧基胺基硫代磷鹽基)水楊酸酯 (IUPAC
 名稱) (473) + TX、伊維菌素 (別名) [CCN] + TX、茛菊素 I (696) + TX、
 茛菊素 II (696) + TX、碘硫磷 (1248) + TX、林丹 (430) + TX、虱蟎脲
 (490) + TX、馬拉硫磷 (492) + TX、丙蟎氰 (1254) + TX、滅蚜磷 (502)
 + TX、二噻磷 (1261) + TX、二甲噻蒾 (別名) [CCN] + TX、蟲蟎畏 (1266)
 + TX、甲胺磷 (527) + TX、殺撲磷 (529) + TX、滅蟲威 (530) + TX、滅
 多威 (531) + TX、溴甲烷 (537) + TX、速滅威 (550) + TX、速滅磷 (556)
 + TX、自克威 (1290) + TX、米爾 (557) + TX、米爾貝肟 (別名) [CCN] +
 TX、丙胺氟 (1293) + TX、久效磷 (561) + TX、茂果 (1300) + TX、莫西
 菌素 (別名) [CCN] + TX、二溴磷 (567) + TX、NC-184 (化合物代碼) + TX、
 NC-512 (化合物代碼) + TX、氟蟻靈 (1309) + TX、尼可黴素 (別名) [CCN]
 + TX、戊氰威 (1313) + TX、戊氰威 1:1 氯化鋅複合物 (1313) + TX、NNI-0101
 (化合物代碼) + TX、NNI-0250 (化合物代碼) + TX、氧化樂果 (594) + TX、

殺線威 (602) + TX、異亞碲磷 (1324) + TX、碲拌磷 (1325) + TX、pp' -DDT (219) + TX、對硫磷 (615) + TX、氯菊酯 (626) + TX、石油 (別名) (628) + TX、芬硫磷 (1330) + TX、稻豐散 (631) + TX、甲拌磷 (636) + TX、伏殺硫磷 (637) + TX、硫環磷 (1338) + TX、亞胺硫磷 (638) + TX、磷胺 (639) + TX、辛硫磷 (642) + TX、甲基嘧啶磷 (652) + TX、氯化松節油 (傳統名) (1347) + TX、瀏陽黴蠶 (別名) (653) + TX、丙氯諾 (1350) + TX、丙溴磷 (662) + TX、蟬虱威 (1354) + TX、克蟎特 (671) + TX、強敵 (673) + TX、殘殺威 (678) + TX、乙噻唑磷 (1360) + TX、發果 (1362) + TX、除蟲菊酯 I (696) + TX、除蟲菊酯 II (696) + TX、除蟲菊酯 (696) + TX、噠蟎靈 (699) + TX、嗒吡硫磷 (701) + TX、噠蟎醚 (706) + TX、噠硫磷 (1370) + TX、噠硫磷 (711) + TX、噠硫磷 (1381) + TX、R-1492 (發展代碼) (1382) + TX、RA-17 (發展代碼) (1383) + TX、魚藤酮 (722) + TX、八甲磷 (1389) + TX、硫線磷 (別名) + TX、司拉克丁 (別名) [CCN] + TX、SI-0009 (化合物代碼) + TX、蘇硫磷 (1402) + TX、螺蟎酯 (738) + TX、甲蟎酯 (739) + TX、SSI-121 (發展代碼) (1404) + TX、舒非侖 (別名) [CCN] + TX、氟蟲胺 (750) + TX、治螟磷 (753) + TX、硫 (754) + TX、SZI-121 (發展代碼) (757) + TX、氟胺氰菊酯 (398) + TX、吡蟎胺 (763) + TX、TEPP (1417) + TX、三級丁威 (別名) + TX、殺蟲威 (777) + TX、三氯殺蟎碲 (786) + TX、殺蟎素 (別名) (653) + TX、殺蟎硫醚 (1425) + TX、thiafenox (別名) + TX、抗蟲威 (1431) + TX、久效威 (800) + TX、甲基乙拌磷 (801) + TX、克殺蟎 (1436) + Tx、蘇雲金素 (別名) [CCN] + TX、威菌磷 (1441) + TX、苯蟎噻 (1443) + TX、三唑磷 (820) + TX、唑蚜威

(triazuron)(別名)+TX、敵百蟲(824)+TX、氯苯乙丙磷(1455)+TX、三活菌素(別名)(653)+TX、蚜滅磷(847)+TX、氟吡唑蟲[CCN]以及YI-5302(複合代碼)+TX，

殺藻劑，該殺藻劑選自由以下物質組成的組：百殺辛(bethoxazin)CN]+TX、二辛酸銅(IUPAC名稱)(170)+TX、硫酸銅(172)+TX、cybutryne[CCN]+TX、二氫萘醌(dichlone)(1052)+TX、雙氯酚(232)+TX、菌多酸(295)+TX、三苯錫(fentin)(347)+TX、熟石灰[CCN]+TX、代森鈉(nabam)(566)+TX、滅藻醌(quinoclamine)(714)+TX、醌苳胺(quinonamid)(1379)+TX、西瑪津(730)+TX、三苯錫乙酸鹽(IUPAC名稱)(347)和氫氧化三苯錫(IUPAC名稱)(347)+TX，

驅蠕蟲劑，該驅蠕蟲劑選自由以下物質組成的組：阿巴美丁(1)+TX、克蘆磷酯(1011)+TX、朵拉克汀(別名)[CCN]+TX、多拉克丁(291)+TX、多拉克丁苯甲酸酯(291)+TX、依立諾克丁(別名)[CCN]+TX、滅線磷(ethoprophos)(312)+TX、伊維菌素(別名)[CCN]+TX、米爾倍黴素(別名)[CCN]+TX、莫昔克丁(別名)[CCN]+TX、哌吡[CCN]+TX、塞拉菌素(selamectin)(別名)[CCN]+TX、多殺菌素(737)和硫菌靈(thiophanate)(1435)+TX，

殺鳥劑，該殺鳥劑選自由以下物質組成的組：氯醛糖(127)+TX、異狄氏劑(1122)+TX、倍硫磷(346)+TX、吡啶-4-胺(IUPAC名稱)(23)和土的寧(745)+TX，

殺細菌劑，該殺細菌劑選自由以下物質組成的組：1-羥基-1*H*-吡啶-2-硫酮(IUPAC名稱)(1222)+TX、4-(喹啉-2-基氨基)苯磺醯胺(IUPAC

名稱)(748) + TX、8-羥基喹啉硫酸鹽(446) + TX、溴硝醇(97) + TX、
二辛酸銅(IUPAC 名稱)(170) + TX、氫氧化銅(IUPAC 名稱)(169) + TX、
甲酚[CCN] + TX、雙氯酚(232) + TX、雙吡硫翁(1105) + TX、多地辛(1112)
+ TX、敵磺鈉(fenaminosulf)(1144) + TX、甲醛(404) + TX、汞加芬(別
名)[CCN] + TX、春雷黴素(483) + TX、春雷黴素鹽酸鹽水合物(483) + TX、
二(二甲基二硫代胺基甲酸鹽)鎳(IUPAC 名稱)(1308) + TX、三氯甲基吡
啶(nitrapyrin)(580) + TX、辛噻酮(octhilinone)(590) + TX、奧索利酸(606)
+ TX、土黴素(611) + TX、羥基喹啉硫酸鉀(446) + TX、烯丙苯噻唑
(probenazole)(658) + TX、鏈黴素(744) + TX、鏈黴素倍半硫酸鹽(744)
+ TX、葉枯酞(766) + TX 扣硫柳汞(別名)[CCN] + TX，

生物試劑，該生物試劑選自由以下物質構成的組：棉褐帶卷蛾顆粒體
病毒(Adoxophyes orana GV)(別名)(12) + TX、放射形土壤桿菌(別名)
(13) + TX、捕食蟎(Amblyseius spp.)(別名)(19) + TX、芹菜夜蛾核多
角體病毒(Anagrapha falcifera NPV)(別名)(28) + TX、Anagrus atomus(別
名)(29) + TX、蚜蟲寄生蜂(Aphelinus abdominalis)(別名)(33) + TX、
棉蚜寄生蜂(Aphidius colemani)(別名)(34) + TX、食蚜瘿蚊(Autographa
californica NPV)(別名)(35) + TX、苜蓿銀紋夜蛾核多角體病毒(Bacillus
firmus)(別名)(38) + TX、堅強芽孢桿菌(Bacillus firmus)(別名)(48) +
TX、球形芽孢桿菌(Bacillus sphaericus Neide)(學名)(49) + TX、蘇雲金
芽孢桿菌(Bacillus thuringiensis Berliner)(學名)(51) + TX、蘇雲金芽孢桿
菌.I(Bacillus thuringiensis subsp. aizawai)(學名)(51) + TX、蘇雲金芽孢桿
菌以色列亞種(Bacillus thuringiensis subsp. israelensis)(學名)(51) + TX、

蘇雲金芽孢桿菌日本亞種 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis*) (學名) (51)
 + TX、蘇雲金芽孢桿菌 k· (*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*) (學名) (51)
 + TX、蘇雲金芽孢桿菌 t· (*Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*) (學名) (51)
 + TX、球孢白僵菌 (*Beauveria bassiana*) (別名) (53) + TX、布氏白僵菌
 (*Beauveria brongniartii*) (別名) (54) + TX、草蜻蛉 (*Chrysoperla carnea*) (別
 名) (151) + TX、孟氏隱唇瓢蟲 (*Cryptolaemus montrouzieri*) (別名) (178)
 + TX、蘋果蠹蛾顆粒體病毒 (*Cydia pomonella* GV) (別名) (191) + TX、西
 伯利亞離顎繭蜂 (*Dacnusa sibirica*) (別名) (212) + TX、豌豆潛葉蠅姬小蜂
 (*Diglyphus isaea*) (別名) (254) + TX、麗蚜小蜂 (*Encarsia formosa*) (學名)
 (293) + TX、槲角蚜小蜂 (*Eretmocerus eremicus*) (別名) (300) + TX、玉
 米穗夜蛾核多角體病毒 (*Helicoverpa zea* NPV) (別名) (431) + TX、嗜菌異
 小桿線蟲 (*Heterorhabditis bacteriophora*) 和 H·*megidis* (別名) (433) + TX、
 會聚長足瓢蟲 (*Hippodamia convergens*) (別名) (442) + TX、橘粉介殼蟲寄
 生蜂 (*Leptomastix dactylopii*) (別名) (488) + TX、盲蝽 (*Macrolophus caliginosus*)
 (別名) (491) + TX、甘藍夜蛾核多角體病毒 (*Mamestra brassicae* NPV) (別
 名) (494) + TX、*Metaphycus helvolus* (別名) (522) + TX、黃綠綠僵菌
 (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) (學名) (523) + TX、金龜子綠僵菌小
 孢變種 (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) (學名) (523) + TX、松黃葉
 蜂 (*Neodiprion sertifer*) 核多角體病毒和紅頭松樹葉蜂 (*N. lecontei*) 核多角
 體病毒 (別名) (575) + TX、小花蝽 (別名) (596) + TX、玫煙色擬青黴
 (*Paecilomyces fumosoroseus*) (別名) (613) + TX、智利捕植蟎 (*Phytoseiulus*
persimilis) (別名) (644) + TX、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua multicapsid*) 多

核衣殼核多角體病毒（學名）（741）+ TX、毛蚊線蟲（*Steinernema bibionis*）（別名）（742）+ TX、小卷蛾斯氏線蟲（*Steinernema carpocapsae*）（別名）（742）+ TX、夜蛾斯氏線蟲（別名）（742）+ TX、*Steinernema glaseri*（別名）（742）+ TX、*Steinernema riobrave*（別名）（742）+ TX、*Steinernema riobavis*（別名）（742）+ TX、*Steinernema scapterisci*（別名）（742）+ TX、斯氏線蟲屬（*Steinernema* spp.）（別名）（742）+ TX、赤眼蜂屬（別名）（826）+ TX、西方盲走蟪（*Typhlodromus occidentalis*）（別名）（844）和蠟蚧輪枝菌（*Verticillium lecanii*）（別名）（848）+ TX，

土壤消毒劑，該土壤消毒劑選自由以下物質組成的組：碘甲烷（IUPAC 名稱）（542）和甲基溴（537）+ TX，

化學不育劑，該化學不育劑選自由以下物質組成的組：啞磷嗪（apholate）[CCN] + TX、雙(氮丙啶)甲胺基磷硫化物（bisazir）（別名）[CCN] + TX、白消安（別名）[CCN] + TX、除蟲脲（250）+ TX、迪麥替夫（dimatif）（別名）[CCN] + TX、六甲蜜胺（hemel）[CCN] + TX、六甲磷（hempa）[CCN] + TX、甲基涕巴（metepa）[CCN] + TX、甲硫涕巴（methiotepa）[CCN] + TX、不育特（methyl apholate）[CCN] + TX、不孕啶（morzid）[CCN] + TX、氟幼脲（penfluron）（別名）[CCN] + TX、涕巴（tepa）[CCN] + TX、硫代六甲磷（thiohempa）（別名）[CCN] + TX、硫涕巴（別名）[CCN] + TX、曲他胺（別名）[CCN]和尿烷亞胺（別名）[CCN] + TX，

昆蟲資訊素，該昆蟲資訊素選自由以下物質組成的組：(E)-癸-5-烯-1-基乙酸酯與(E)-癸-5-烯-1-醇（IUPAC 名稱）（222）+ TX、(E)-十三碳-4-烯-1-基乙酸酯（IUPAC 名稱）（829）+ TX、(E)-6-甲基庚-2-烯-4-醇（IUPAC 名稱）

(541)+TX、(E,Z)-十四碳-4,10-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC 名稱)(779)+TX、
 (Z)-十二碳-7-烯-1-基乙酸酯(IUPAC 名稱)(285)+TX、(Z)-十六碳-11-烯醛
 (IUPAC 名稱)(436)+TX、(Z)-十六碳-11-烯-1-基乙酸酯(IUPAC 名稱)
 (437)+TX、(Z)-十六碳-13-烯-11-炔-1-基乙酸酯(IUPAC 名稱)(438)+TX、
 (Z)-二十-13-烯-10-酮(IUPAC 名稱)(448)+TX、(Z)-十四碳-7-烯-1-醛(IUPAC
 名稱)(782)+TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-醇(IUPAC 名稱)(783)+TX、(Z)-
 十四碳-9-烯-1-基乙酸酯(IUPAC 名稱)(784)+TX、(7E,9Z)-十二碳-7,9-二
 烯-1-基乙酸酯(IUPAC 名稱)(283)+TX、(9Z,11E)-十四碳-9,11-二烯-1-基
 乙酸酯(IUPAC 名稱)(780)+TX、(9Z,12E)-十四碳-9,12-二烯-1-基乙酸酯
 (IUPAC 名稱)(781)+TX、14-甲基十八-1-烯(IUPAC 名稱)(545)+TX、
 4-甲基壬醛-5-醇與4-甲基壬醛-5-酮(IUPAC 名稱)(544)+TX、 α -多紋素
 (multistriatin)(別名)[CCN]+TX、西部松小蠹集合資訊素(brevicomins)
 (別名)[CCN]+TX、十二碳二烯醇(codlure)(別名)[CCN]+TX、十二
 碳二烯醇(codlemone)(別名)(167)+TX、誘蠅酮(cuelure)(別名)(179)
 +TX、環氧十九烷(disparlure)(277)+TX、十二碳-8-烯-1-基乙酸酯(IUPAC
 名稱)(286)+TX、十二碳-9-烯-1-基乙酸酯(IUPAC 名稱)(287)+TX、
 十二碳-8+TX、10-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC 名稱)(284)+TX、dominicalure
 (別名)[CCN]+TX、4-甲基辛酸乙酯(IUPAC 名稱)(317)+TX、丁香酚
 (別名)[CCN]+TX、南部松小蠹集合資訊素(frontalin)(別名)[CCN]+TX、
 誘蟲十六酯(gossyplure)(別名)(420)+TX、誘殺烯混劑(grandlure)(421)
 +TX、誘殺烯混劑I(別名)(421)+TX、誘殺烯混劑II(別名)(421)+TX、
 誘殺烯混劑III(別名)(421)+TX、誘殺烯混劑IV(別名)(421)+TX、

醋酸十六烯酯(hexalure)[CCN] + TX、齒小蠹二烯醇(ipsdienol)(別名)[CCN] + TX、小蠹烯醇(ipsenol)(別名)[CCN] + TX、金龜子性誘劑(japonilure)(別名)(481) + TX、lineatin(別名)[CCN] + TX、litlure(別名)[CCN] + TX、粉紋夜蛾性誘劑(looplure)(別名)[CCN] + TX、誘殺酯(medlure)[CCN] + TX、megatomoic acid(別名)[CCN] + TX、誘蟲醚(methyl eugenol)(別名)(540) + TX、誘蟲烯(muscalure)(563) + TX、十八-2,13-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC 名稱)(588) + TX、十八-3,13-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC 名稱)(589) + TX、賀康彼(orfralure)(別名)[CCN] + TX、oryctalure(別名)(317) + TX、非樂康(ostramone)(別名)[CCN] + TX、誘蟲環(siglure)[CCN] + TX、sordidin(別名)(736) + TX、食菌甲誘醇(sulcatol)(別名)[CCN] + TX、十四-11-烯-1-基乙酸酯(IUPAC 名稱)(785) + TX、特誘酮(839) + TX、特誘酮 A(別名)(839) + TX、特誘酮 B₁(別名)(839) + TX、特誘酮 B₂(別名)(839) + TX、特誘酮 C(別名)(839) 和 trunc-call(別名)[CCN] + TX，

昆蟲驅避劑，該昆蟲驅避劑選自以下物質組成的組：2-(辛基硫代)乙醇(IUPAC 名稱)(591) + TX、避蚊酮(butopyronoxyl)(933) + TX、丁氧基(聚丙二醇)(936) + TX、己二酸二丁酯(IUPAC 名稱)(1046) + TX、鄰苯二甲酸二丁酯(1047) + TX、丁二酸二丁酯(IUPAC 名稱)(1048) + TX、避蚊胺[CCN] + TX、驅蚊酯(dimethyl carbate)[CCN] + TX、鄰苯二甲酸二甲酯[CCN] + TX、乙基己二醇(1137) + TX、己脲[CCN] + TX、甲喹丁(methoquin-butyl)(1276) + TX、甲基新癸醯胺[CCN] + TX、草醯胺酸酯酯(oxamate)[CCN]和羥哌酯[CCN] + TX，

殺昆蟲劑，該殺昆蟲劑選自由以下物質組成的組：1-二氯-1-硝基乙烷

(IUPAC/化學文摘名稱)(1058) + TX、1,1-二氯-2,2-雙(4-乙基苯基)乙烷
 (IUPAC 名稱)(1056) + TX、1,2-二氯丙烷 (IUPAC/化學文摘名稱)(1062)
 + TX、具有 1,3-二氯丙烯的 1,2-二氯丙烷 (IUPAC 名稱)(1063) + TX、1-
 溴-2-氯乙烷 (IUPAC/化學文摘名稱)(916) + TX、2,2,2-三氯-1-(3,4-二氯-苯
 基)乙酸乙酯 (IUPAC 名)(1451) + TX、2,2-二氯乙烯基 2-乙基亞磺基乙
 基甲基磷酸酯 (IUPAC 名)(1066) + TX、2-(1,3-1,3-二硫戊烷-2-基)苯基二
 甲基胺基甲酸酯 (IUPAC/化學文摘名稱)(1109) + TX、2-(2-三級氧基乙氧
 基)乙基硫氰酸酯 (IUPAC/化學文摘名稱)(935) + TX、2-(4,5-二甲基-1,3-
 二氧戊環-2-基)苯基甲基胺基甲酸酯 (IUPAC/化學文摘名稱)(1084) + TX、
 2-(4-氯-3,5-二甲基苯氧基)乙醇 (IUPAC 名)(986) + TX、2-氯乙烯基二乙基
 磷酸酯 (IUPAC 名)(984) + TX、2-咪唑啉酮 (IUPAC 名)(1225) + TX、
 2-isovalerylindan-1,3-二酮 (IUPAC 名)(1246) + TX、2-甲基(丙-2-炔基)胺基
 苯基甲基胺基甲酸酯 (IUPAC 名)(1284) + TX、2-硫氰酸醇乙基月桂酸酯
 (IUPAC 名)(1433) + TX、3-溴-1-氯丙-1-烯 (IUPAC 名)(917) + TX、3-
 甲基-1-苯基吡啶-5-基二甲基-胺基甲酸酯 (IUPAC 名)(1283) + TX、4-甲基
 (丙-2-炔基)胺基-3,5-二甲苯基基甲基胺基甲酸酯 (IUPAC 名)(1285) + TX、
 5,5-二甲基-3-側氧基環己-1-烯基二甲基胺基甲酸酯 (IUPAC 名)(1085) +
 TX、阿巴汀(1) + TX、乙醯甲胺磷(2) + TX、啉蟲脒(4) + TX、家蠅磷
 殺蟲劑(別名)[CCN] + TX、乙醯蟲腈[CCN] + TX、氟丙菊酯(9) + TX、
 丙烯腈 (IUPAC 名)(861) + TX、棉鈴威(15) + TX、涕滅威(16) + TX、
 涕滅虱威(863) + TX、艾氏劑(864) + TX、烯丙菊酯(17) + TX、阿洛胺
 菌素(別名)[CCN] + TX、除害威(866) + TX、 α -氯氰菊酯(202) + TX、

α -蛻皮激素（別名）[CCN] + TX、磷化鋁（640）+ TX、賽果（870）+ TX、果滿磷（872）+ TX、滅害威（873）+ TX、胺吸磷殺蟎劑（875）+ TX、草酸氫胺吸磷（amiton hydrogen oxalate）（875）+ TX、雙甲脒（24）+ TX、新菸鹼（877）+ TX、乙基殺撲磷（883）+ TX、AVI 382（化合物代碼）+ TX、AZ 60541（化合物代碼）+ TX、印楝素（別名）（41）+ TX、甲基吡啶磷（42）+ TX、乙基穀硫磷（44）+ TX、甲基穀硫磷（45）+ TX、偶氮磷（889）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌 δ 內毒素（別名）（52）+ TX、六氟矽酸鋇（別名）[CCN] + TX、多硫化鋇（IUPAC/化學文摘名稱）（892）+ TX、熏菊酯[CCN] + TX、拜耳 22/190（發展代碼）（893）+ TX、拜耳 22408（發展代碼）（894）+ TX、惡蟲威（58）+ TX、丙硫克百威（60）+ TX、殺蟲磷（66）+ TX、 β -氟氯氰菊酯（194）+ TX、 β -氯氰菊酯（203）+ TX、聯苯菊酯（76）+ TX、生物丙烯菊酯（78）+ TX、生物丙烯菊酯 S-環戊烯基異構物（別名）（79）+ TX、戊環苄呋菊酯[CCN] + TX、生物氯菊酯（908）+ TX、苄呋菊脂（80）+ TX、雙(2-氯乙基)醚（IUPAC 名）（909）+ TX、雙三氟蟲脲（83）+ TX、硼砂（86）+ TX、溴滅菊酯（別名）+ TX、溴苯烯磷（914）+ TX、溴烯殺（918）+ TX、溴-DDT（別名）[CCN] + TX、溴硫磷（920）+ TX、溴硫磷-乙基（921）+ TX、合殺威（924）+ TX、稻虱淨（99）+ TX、畜蟲威（926）+ TX、特密硫磷（927）+ TX、丁酮威（103）+ TX、丁酯磷（932）+ TX、丁酮虱威（104）+ TX、丁基噻蟎靈（別名）+ TX、硫線磷（109）+ TX、砷酸鈣[CCN] + TX、氰化鈣（444）+ TX、多硫化鈣（IUPAC 名稱）（111）+ TX、毒殺芬（941）+ TX、氯滅殺威（943）+ TX、西維因（115）+ TX、卡巴呋喃（118）+ TX、二硫化碳（IUPAC/化學文摘名稱）（945）+ TX、四氯化碳（IUPAC 名）（946）+

TX、三硫磷(947)+TX、丁硫克百威(119)+TX、殺螟丹(123)+TX、
鹽酸殺螟丹(123)+TX、瑟瓦定(別名)(725)+TX、冰片丹(960)+TX、
氯丹(128)+TX、十氯酮(963)+TX、殺蟲脒(964)+TX、鹽酸殺蟲脒
(964)+TX、氯氧磷(129)+TX、溴蟲腈(130)+TX、毒蟲畏(131)+TX、
氟啶脲(132)+TX、氯甲磷(136)+TX、氯仿[CCN]+TX、氯化苦(141)
+TX、氯膦肟磷(989)+TX、氯吡唑磷(990)+TX、毒死蜱(145)+TX、
毒死蜱-甲基(146)+TX、蟲蟊磷(994)+TX、環蟲醯肟(150)+TX、瓜
菊酯 I (696)+TX、瓜菊酯 II (696)+TX、瓜菊酯(696)+TX、順式-苄
呋菊酯(別名)+TX、順式苄呋菊酯(80)+TX、三氟氯氰菊酯(別名)+
TX、地蟲威(999)+TX、氯氰碘柳胺(別名)[CCN]+TX、噻蟲胺(165)
+TX、乙醯亞砷酸銅[CCN]+TX、砷酸銅[CCN]+TX、油酸銅[CCN]+TX、
蠅毒磷(174)+TX、畜蟲磷(1006)+TX、克羅米通(別名)[CCN]+TX、
巴毒磷(1010)+TX、育畜磷(1011)+TX、冰晶石(別名)(177)+TX、
CS 708(發展代碼)(1012)+TX、苯腈磷(1019)+TX、殺螟腈(184)+TX、
果蟲磷(1020)+TX、環蟲菊酯[CCN]+TX、乙氰菊酯(188)+TX、氟氯
氰菊酯(193)+TX、三氟氯氰菊酯(196)+TX、氯氰菊酯(201)+TX、
苯氰菊酯(206)+TX、滅蠅胺(209)+TX、畜蜱磷(別名)[CCN]+TX、
d-檸檬烯(別名)[CCN]+TX、d-胺菊酯(別名)(788)+TX、DAEP(1031)
+TX、棉隆(216)+TX、DDT(219)+TX、一甲呋喃丹(1034)+TX、溴
氰菊酯(223)+TX、田樂磷(1037)+TX、田樂磷-O(1037)+TX、田樂
磷-S(1037)+TX、內吸磷(1038)+TX、內吸磷-甲基(224)+TX、內吸
磷-O(1038)+TX、內吸磷-O-甲基(224)+TX、內吸磷-S(1038)+TX、

內吸磷-S-甲基(224)+TX、橫吸磷(demeton-S-methylsulphon)(1039)+TX、
 丁醚脲(226)+TX、氯亞胺硫磷(1042)+TX、二胺磷(1044)+TX、二
 嗪農(227)+TX、異氯硫磷(1050)+TX、除線磷(1051)+TX、敵敵畏
 (236)+TX、二克磷(別名)+TX、敵來死(別名)[CCN]+TX、百治磷
 (243)+TX、地昔尼爾(244)+TX、狄氏劑(1070)+TX、5-甲基吡啶-3-
 基磷酸二乙基酯(IUPAC名)(1076)+TX、除蟲脲(250)+TX、雙羥丙
 茶鹼(別名)[CCN]+TX、四氟甲醚菊酯[CCN]+TX、甲氟磷(1081)+TX、
 地麥威(1085)+TX、樂果(262)+TX、苄菌酯(1083)+TX、甲基毒蟲
 畏(265)+TX、敵蠅威(1086)+TX、消螨酚(1089)+TX、消螨酚
 (dinex-diclexine)(1089)+TX、丙硝酚(1093)+TX、戊硝酚(1094)+TX、
 地樂酚(1095)+TX、呋蟲胺(271)+TX、苯蟲醚(1099)+TX、蔬果磷
 (1100)+TX、二氧威(1101)+TX、敵殺磷(1102+TX)、乙拌磷(278)
 +TX、噻喃磷(1108)+TX、DNOC(282)+TX、朵拉菌素(別名)[CCN]
 +TX、DSP(1115)+TX、脫皮甾酮(別名)[CCN]+TX、EI 1642(發展代
 碼)(1118)+TX、甲胺基阿巴汀(291)+TX、甲胺基阿巴汀苯甲酸鹽(291)
 +TX、EMPC(1120)+TX、烯炔菊酯(292)+TX、硫丹(294)+TX、因
 毒磷(1121)+TX、安特靈(1122)+TX、EPBP(1123)+TX、EPN(297)
 +TX、保幼醚(1124)+TX、依立諾克丁(別名)[CCN]+TX、高氰戊菊酯
 (302)+TX、依他伏殺(別名)[CCN]+TX、殺蟲丹(308)+TX、乙硫磷
 (309)+TX、乙蟲清(310)+TX、益果-甲基(1134)+TX、滅線磷(312)
 +TX、甲酸乙酯(IUPAC名)[CCN]+TX、乙基-DDD(別名)(1056)+TX、
 二溴化乙烯(316)+TX、二氯化乙烯(化學名稱)(1136)、環氧乙烷[CCN]、

醚菊酯 (319) + TX、乙嘧硫磷 (1142) + TX、EXD (1143) + TX、胺磺磷
 (323) + TX、克線磷 (326) + TX、抗蟎唑 (1147) + TX、皮蠅硫磷 (1148)
 + TX、乙苯威 (1149) + TX、五氟苯菊酯 (1150) + TX、殺螟硫磷 (335) +
 TX、二級丁威 (336) + TX、非諾克林 (1153) + TX、苯氧威 (340) + TX、
 吡氣氰菊酯 (1155) + TX、甲氰菊酯 (342) + TX、吡蟎胺 (別名) + TX、
 豐索磷 (1158) + TX、倍硫磷 (346) + TX、倍硫磷-乙基[CCN] + TX、氰戊
 菊酯 (349) + TX、氟蟲腓 (354) + TX、氟尼胺 (358) + TX、氟蟲雙醯胺
 (CAS 登記號：272451-65-7) + TX、伏康脲 (1168) + TX、氟環脲 (366) +
 TX、氟氰戊菊酯 (367) + TX、聯氟蟎 (1169) + TX、嘧蟲胺[CCN] + TX、
 氟芬隆 (370) + TX、三氟醚 (1171) + TX、氟氯苯菊酯 (372) + TX、氟胺
 氰菊酯 (1184) + TX、FMC 1137 (發展代碼) (1185) + TX、地蟲磷 (1191)
 + TX、殺蟎脒 (405) + TX、鹽酸殺蟎脒 (405) + TX、安果 (1192) + TX、
 胺甲威 (1193) + TX、丁苯硫磷 (1194) + TX、福司吡酯 (1195) + TX、噻
 唑磷 (408) + TX、丁硫環磷 (1196) + TX、呋線威 (412) + TX、抗蟲菊 (1200)
 + TX、 γ -三氟氯氰菊酯 (197) + TX、 γ -HCH (430) + TX、雙胍鹽 (422)
 + TX、乙酸雙胍鹽 (422) + TX、GY-81 (發展代碼) (423) + TX、苧蟎醚
 (424) + TX、氯蟲醯肼 (425) + TX、HCH (430) + TX、HEOD (1070) + TX、
 七氯 (1211) + TX、庚烯磷 (432) + TX、速殺硫磷[CCN]、氟鈴脲 (439) +
 TX、HHDN (864) + TX、氟蟻肼 (443) + TX、氰化氫 (444) + TX、烯蟲
 乙酯 (445) + TX、奮淋威 (1223) + TX、吡蟲啉 (458) + TX、呋咪菊酯 (460)
 + TX、茚蟲威 (465) + TX、碘甲烷 (IUPAC 名) (542) + TX、IPSP (1229)
 + TX、苯線磷 (1231) + TX、碳氯靈 (1232) + TX、水胺硫磷 (別名) (473)

+ TX、異艾氏劑 (1235) + TX、異柳磷 (1236) + TX、移栽靈 (1237) + TX、
 葉蟬散 (472) + TX、O-(甲氧基-胺基硫代磷醯基)水楊酸異丙基酯 (IUPAC
 名)(473) + TX、稻瘟靈 (474) + TX、異拌磷 (1244) + TX、異惡唑磷 (480)
 + TX、伊佛黴素 (別名) [CCN] + TX、茉莉菊酯 I (696) + TX、茉莉菊酯
 II (696) + TX、碘硫磷 (1248) + TX、保幼激素 I (別名) [CCN] + TX、保
 幼激素 II(別名)[CCN] + TX、保幼激素 III(別名)[CCN] + TX、氯戊環(1249)
 + TX、烯蟲炔酯 (484) + TX、λ-三氟氯氰菊酯 (198) + TX、砷酸鉛[CCN]
 + TX、雷皮菌素 (CCN) + TX、溴苯磷 (1250) + TX、林丹 (430) + TX、
 啶蟲磷 (1251) + TX、虱蟎脲 (490) + TX、噻唑磷 (1253) + TX、甲基胺
 基甲酸間異丙苯基酯 (IUPAC 名)(1014) + TX、磷化鎂 (IUPAC 名)(640)
 + TX、馬拉硫磷 (492) + TX、丙蟎氰 (1254) + TX、疊氮磷 (1255) + TX、
 滅蚜磷 (502) + TX、甲基滅蚜磷 (1258) + TX、滅蚜松 (1260) + TX、地
 安磷 (1261) + TX、氯化亞汞 (513) + TX、甲亞碲磷 (1263) + TX、氰氟
 蟲脞 (CCN) + TX、威百畝 (519) + TX、威百畝-鉀 (別名)(519) + TX、
 威百畝-鈉 (519) + TX、蟲蟎畏 (1266) + TX、甲胺磷 (527) + TX、氟化
 甲磺醯基 (IUPAC/化學文摘名稱)(1268) + TX、殺撲磷 (529) + TX、滅
 蟲威 (530) + TX、殺蟲乙烯磷 (1273) + TX、滅多蟲 (531) + TX、烯蟲酯
 (532) + TX、奎納克林-丁基 (1276) + TX、甲醚菊酯 (別名)(533) + TX、
 甲氧滴滴涕 (534) + TX、甲氧蟲醯肼 (535) + TX、甲基溴 (537) + TX、
 異硫氰酸甲酯 (543) + TX、甲基氯仿 (別名) [CCN] + TX、氯化甲烷[CCN]
 + TX、甲氧苄氟菊酯[CCN] + TX、速滅威 (550) + TX、惡蟲酮 (1288) + TX、
 速滅磷 (556) + TX、茲克威 (1290) + TX、密滅汀 (557) + TX、米爾貝肼

(別名) [CCN] + TX、丙胺氟 (1293) + TX、滅蟻靈 (1294) + TX、久效磷 (561) + TX、茂果 (1300) + TX、莫昔克丁 (別名) [CCN] + TX、蔡肽磷 (別名) [CCN] + TX、二溴磷 (567) + TX、蔡 (IUPAC/化學文摘名稱) (1303) + TX、NC-170 (發展代碼) (1306) + TX、NC-184 (化合物代碼) + TX、菸鹼 (578) + TX、硫酸菸鹼 (578) + TX、氟蟻靈 (1309) + TX、烯啶蟲胺 (579) + TX、硝乙脲噻唑 (1311) + TX、戊氰威 (1313) + TX、戊氰威 1:1 氯化鋅錯合物 (1313) + TX、NNI-0101 (化合物代碼) + TX、NNI-0250 (化合物代碼) + TX、降菸鹼 (傳統名稱) (1319) + TX、雙苯氟脲 (585) + TX、多氟脲 (586) + TX、乙基硫代磷酸 O-2,5-二氯-4-碘苯基 O-乙基酯 (IUPAC 名) (1057) + TX、硫代磷酸 O,O-二乙基 O-4-甲基-2-側氧基-2H-色烯-7-基酯 (IUPAC 名) (1074) + TX、硫代磷酸 O,O-二乙基 O-6-甲基-2-丙基嘧啶-4-基酯 (IUPAC 名) (1075) + TX、二硫代焦磷酸 O,O,O',O' -四丙基酯 (IUPAC 名) (1424) + TX、油酸 (IUPAC 名) (593) + TX、氧樂果 (594) + TX、草胺膦 (602) + TX、亞砒磷 (oxydemeton-methyl) (609) + TX、異亞砒磷 (1324) + TX、砒拌磷 (1325) + TX、pp' -DDT (219) + TX、對二氯苯 [CCN] + TX、對硫磷 (615) + TX、對硫磷-甲基 (616) + TX、氟幼脲 (別名) [CCN] + TX、五氯苯酚 (623) + TX、月桂酸五氯苯基酯 (IUPAC 名) (623) + TX、苄氯菊酯 (626) + TX、石油 (別名) (628) + TX、PH 60-38 (發展代碼) (1328) + TX、芬硫磷 (1330) + TX、苯醚菊酯 (630) + TX、稻豐散 (631) + TX、甲拌磷 (636) + TX、伏殺磷 (637) + TX、硫環磷 (1338) + TX、亞胺硫磷 (638) + TX、對氯硫磷 (1339) + TX、磷胺 (639) + TX、磷 (IUPAC 名稱) (640) + TX、辛硫磷 (642) + TX、辛硫磷-甲基 (1340) + TX、甲胺啉磷

(1344) + TX、抗蚜威 (651) + TX、嘧啶磷-乙基 (1345) + TX、嘧啶磷-甲基 (652) + TX、聚氯二環戊二烯異構物 (IUPAC 名) (1346) + TX、聚氯萸烯 (傳統名稱) (1347) + TX、亞砷酸鉀[CCN] + TX、硫氰酸鉀[CCN] + TX、炔丙菊酯 (655) + TX、早熟素 I (別名) [CCN] + TX、早熟素 II (別名) [CCN] + TX、早熟素 III (別名) [CCN] + TX、乙醯嘧啶磷 (1349) + TX、丙溴磷 (662) + TX、丙氟菊酯[CCN] + TX、蜚虱威 (1354) + TX、猛殺威 (1355) + TX、丙蟲磷 (1356) + TX、巴胺磷 (673) + TX、殘殺威 (678) + TX、乙噻唑磷 (1360) + TX、丙硫磷 (686) + TX、發硫磷 (1362) + TX、丙苯烴菊酯[CCN] + TX、吡蚜酮 (688) + TX、吡唑硫磷 (689) + TX、定菌磷 (693) + TX、反滅蟲菊 (1367) + TX、除蟲菊酯 I (696) + TX、除蟲菊酯 II (696) + TX、除蟲菊酯 (696) + TX、噻蟊靈 (699) + TX、啖蟲丙醚 (700) + TX、嗒吡硫磷 (701) + TX、嘧蟊醚 (706) + TX、嘧硫磷 (1370) + TX、吡丙醚 (708) + TX、苦木 (別名) [CCN] + TX、喹惡磷 (711) + TX、喹惡磷-甲基 (1376) + TX、畜寧磷 (1380) + TX、喹硫磷 (1381) + TX、R-1492 (發展代碼) (1382) + TX、碘醚柳胺 (別名) [CCN] + TX、苜呿菊脂 (719) + TX、魚藤酮 (722) + TX、RU 15525 (發展代碼) (723) + TX、RU 25475 (發展代碼) (1386) + TX、魚尼丁 (別名) (1387) + TX、利阿諾定 (傳統名稱) (1387) + TX、沙巴黎蘆 (別名) (725) + TX、八甲磷 (1389) + TX、克線丹 (別名) + TX、司拉克丁 (別名) [CCN] + TX、SI-0009 (化合物代碼) + TX、SI-0205 (化合物代碼) + TX、SI-0404 (化合物代碼) + TX、SI-0405 (化合物代碼) + TX、氟矽菊酯 (728) + TX、SN 72129 (發展代碼) (1397) + TX、亞砷酸鈉[CCN] + TX、氰化鈉 (444) + TX、氟化鈉 (IUPAC/

化學文摘名稱)(1399)+TX、六氟矽酸鈉(1400)+TX、五氯酚鈉(623)+TX、硒酸鈉(IUPAC 名稱)(1401)+TX、硫氰酸鈉[CCN]+TX、蘇硫磷(1402)+TX、多殺菌素(737)+TX、螺甲蟎酯(739)+TX、螺蟲乙酯(CCN)+TX、磺苯醌隆(746)+TX、磺苯醌隆-鈉(746)+TX、氟蟲胺(750)+TX、治螟磷(753)+TX、氟化硫鹽基(756)+TX、硫丙磷(1408)+TX、焦油(別名)(758)+TX、氟胺氰菊酯(tau-fluvalinate)(398)+TX、噻蟎威(1412)+TX、TDE(1414)+TX、蟲醯肼(762)+TX、吡蟎胺(763)+TX、丁基嘧啶磷(764)+TX、氟苯脲(768)+TX、七氟菊酯(769)+TX、雙硫磷(770)+TX、TEPP(1417)+TX、環戊烯丙菊酯(1418)+TX、三級丁威(別名)+TX、特丁磷(773)+TX、四氯乙烷[CCN]+TX、殺蟲畏(777)+TX、胺菊酯(787)+TX、 θ -氯氰菊酯(204)+TX、噻蟲啉(791)+TX、噻芬諾(別名)+TX、噻蟲嗪(792)+TX、苯噻硫磷(1428)+TX、抗蟲威(1431)+TX、殺蟲環(798)+TX、草酸氫殺蟲環(798)+TX、硫敵克(799)+TX、久效威(800)+TX、甲基乙拌磷(801)+TX、硫磷嗪(1434)+TX、殺蟲雙(803)+TX、殺蟲雙(thiosultap-sodium)(803)+TX、蘇雲金素(別名)[CCN]+TX、啞蟲醯胺(809)+TX、四溴菊酯(812)+TX、四氟苯菊酯(813)+TX、反氯菊酯(1440)+TX、威菌磷(1441)+TX、啞蚜威(818)+TX、三唑磷(820)+TX、啞呀威(別名)+TX、三氯磷酸酯(824)+TX、異皮蠅磷-3(別名)[CCN]+TX、毒壤磷(1452)+TX、三氯丙氧磷(1455)+TX、殺蟲隆(835)+TX、混殺威(840)+TX、烯蟲硫酯(1459)+TX、蚜滅多(847)+TX、氟吡啞蟲[CCN]+TX、藜蘆定(別名)(725)+TX、藜蘆鹼(別名)(725)+TX、XMC(853)+TX、滅殺威

(854)+ TX、YI-5302(化合物代碼)+ TX、C-氯氰菊酯(205)+ TX、zetamethrin (別名)+ TX、磷化辭(640)+ TX、zolaprofos(1469)和 ZXI 8901(發展代碼)(858)+ TX、氰蟲醯胺[736994-63-19]+ TX、氯蟲苯甲醯胺[500008-45-7]+ TX、腈吡蟎酯[560121-52-0]+ TX、丁氟蟎酯[400882-07-7]+ TX、新啞啞啞[337458-27-2]+ TX、乙基多殺菌素[187166-40-1+187166-15-0]+ TX、螺蟲乙酯[203313-25-1]+ TX、虱蟲啉[946578-00-3]+ TX、丁烯氟蟲腈[704886-18-0]+ TX、氯氟醚菊酯[915288-13-0]+ TX、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)[84937-88-2]+ TX、triflumezopyrim+ TX(在 WO 2012/092115 所公開的),

殺軟體動物劑,該殺軟體動物劑選自由以下物質組成的組:二(三丁基錫)氧化物(IUPAC 名稱)(913)+ TX、溴乙醯胺[CCN]+ TX、砷酸鈣[CCN]+ TX、除線威(cloethocarb)(999)+ TX、乙醯亞砷酸銅[CCN]+ TX、硫酸銅(172)+ TX、三苯錫(347)+ TX、磷酸鐵(IUPAC 名稱)(352)+ TX、四聚乙醛(518)+ TX、滅蟲威(530)+ TX、氯硝柳胺(576)+ TX、氯硝柳胺乙醇胺鹽(576)+ TX、五氯酚(623)+ TX、五氯苯氧化鈉(623)+ TX、噻蟎威(tazimcarb)(1412)+ TX、硫雙威(799)+ TX、三丁基氧化錫(913)+ TX、殺螺味啉(trifenmorph)(1454)+ TX、混殺威(trimethacarb)(840)+ TX、乙酸三苯基錫(IUPAC 名稱)(347)和三苯基氫氧化錫(IUPAC 名稱)(347)+ TX、皮瑞普(pyriprole)[394730-71-3]+ TX,

殺線蟲劑,該殺線蟲劑選自由以下物質組成的組:AKD-3088(化合物代碼)+ TX、1,2-二溴-3-氯丙烷(IUPAC/化學文摘名)(1045)+ TX、1,2-二氯丙烷(IUPAC/化學文摘名)(1062)+ TX、1,2-二氯丙烷與 1,3-二氯丙烯(IUPAC 名稱)(1063)+ TX、1,3-二氯丙烯(233)+ TX、3,4-二氯四氫噻

吩 1,1-二氧化物 (IUPAC/化學文摘名) (1065) + TX、3-(4-氯苯基)-5-甲基玫瑰寧 (IUPAC 名稱) (980) + TX、5-甲基-6-硫代-1,3,5-噻二吡咻-3-基乙酸 (IUPAC 名稱) (1286) + TX、6-異戊烯基胺基嘌呤 (替代名稱) (210) + TX、阿巴美丁 (1) + TX、乙醯蟲腈 [CCN] + TX、棉鈴威 (15) + TX、涕滅威 (aldicarb) (16) + TX、涕滅虱威 (aldoxycarb) (863) + TX、AZ 60541 (化合物代碼) + TX、benclonthiaz [CCN] + TX、苯菌靈 (62) + TX、丁基噻蟎酮 (butylpyridaben) (替代名稱) + TX、硫線磷 (cadusafos) (109) + TX、克百威 (carbofuran) (118) + TX、二硫化碳 (945) + TX、丁硫克百威 (119) + TX、氯化苦 (141) + TX、毒死蜱 (145) + TX、除線威 (cloethocarb) (999) + TX、細胞分裂素 (cytokinins) (替代名稱) (210) + TX、棉隆 (216) + TX、DBCP (1045) + TX、DCIP (218) + TX、除線特 (diamidafos) (1044) + TX、除線磷 (dichlofenthion) (1051) + TX、二克磷 (dicliphos) (替代名稱) + TX、樂果 (262) + TX、多拉克丁 (替代名稱) [CCN] + TX、苯甲酸多拉克丁 (291) + TX、依立諾克丁 (291) + TX、(替代名稱) [CCN] + TX、滅線磷 (312) + TX、二溴乙烷 (316) + TX、苯線磷 (fenamiphos) (326) + TX、吡蟎胺 (替代名稱) + TX、豐索磷 (fenpyrad) (1158) + TX、噻唑磷 (fosthiazate) (408) + TX、丁硫環磷 (fosthietan) (1196) + TX、糠醛 (替代名稱) [CCN] + TX、GY-81 (發展代碼) (423) + TX、速殺硫磷 (heterophos) [CCN] + TX、碘甲烷 (IUPAC 名稱) (542) + TX、isamidofos (1230) + TX、氯唑磷 (isazofos) (1231) + TX、激動素 (kinetin) (替代名稱) [CCN] + TX、糠胺基嘌呤 (mecarphon) (替代名稱) (210) + TX、甲基滅蚜磷 (mecarphon) (1258) + TX、威百畝 (519) + TX、威百畝鉀鹽 (替代名稱) (519) + TX、威百畝鈉鹽 (519) + TX、甲

基溴(537)+TX、異硫氰酸甲酯(543)+TX、殺蟎菌素肟(milbemycin oxime)
 (替代名稱)[CCN]+TX、莫昔克丁(別名)[CCN]+TX、疣孢漆斑菌
 (Myrothecium verrucaria)組分(替代名稱)(565)+TX、NC-184(化合物
 代碼)+TX、殺線威(602)+TX、甲拌磷(636)+TX、磷胺(639)+TX、
 磷蟲威(phosphocarb)[CCN]+TX、硫線磷(sebufos)(替代名稱)+TX、
 塞拉菌素(selamectin)(替代名稱)[CCN]+TX、多殺菌素(737)+TX、三
 級丁威(terbam)(替代名稱)+TX、特丁磷(terbufos)(773)+TX、四氯
 噻吩(IUPAC/化學文摘名)(1422)+TX、thiaf enox(替代名稱)+TX、蟲
 線磷(thionazin)(1434)+TX、三唑磷(triazophos)(820)+TX、triazuron
 (替代名稱)+TX、二甲苯酚[CCN]+TX、YI-5302(化合物代碼)和玉米
 素(替代名稱)(210)+TX、fluensulfone [318290-98-1]+TX，

硝化作用抑制劑，該硝化作用抑制劑選自由以下物質組成的組：乙基
 黃原酸鉀[CCN]以及氯啶(nitrapyrin)(580)+TX，

植物活化劑，該植物活化劑選自由以下物質組成的組：噻二唑素
 (acibenzolar)(6)+TX、噻二唑素-S-甲基(6)+TX、烯丙苯噻唑(probenazole)
 (658)和大虎杖(Reynoutria sachalinensis)提取物(替代名稱)(720)+TX，

殺鼠劑，該殺鼠劑選自由以下物質組成的組：2-異戊醯二氫茛-1,3-二酮
 (IUPAC 名稱)(1246)+TX、4-(噻啉-2-基胺基)苯磺醯胺(IUPAC 名稱)
 (748)+TX、 α -氯代醇[CCN]+TX、磷化鋁(640)+TX、安妥(880)+TX、
 三氧化二砷(882)+TX、碳酸鋇(891)+TX、雙鼠脲(912)+TX、溴鼠
 隆(89)+TX、溴敵隆(91)+TX、溴鼠胺(92)+TX、氰化鈣(444)+TX、
 氮醛糖(127)+TX、氯鼠酮(140)+TX、維生素D3(替代名稱)(850)+

TX、氯滅鼠靈 (1004) + TX、克滅鼠 (1005) + TX、殺鼠萘 (175) + TX、殺鼠嘧啶 (1009) + TX、鼠得克 (246) + TX、噻鼠靈 (249) + TX、敵鼠鈉 (273) + TX、維生素 D2 (301) + TX、氟鼠靈 (357) + TX、氟乙醯胺 (379) + TX、鼠撲定 (1183) + TX、鹽酸鼠撲定 (1183) + TX、 γ -HCH (430) + TX、HCH (430) + TX、氫氰酸 (444) + TX、碘甲烷 (IUPAC 名稱) (542) + TX、林旦 (430) + TX、磷化鎂 (IUPAC 名稱) (640) + TX、甲基溴 (537) + TX、鼠特靈 (1318) + TX、毒鼠磷 (1336) + TX、磷化氫 (IUPAC 名稱) (640) + TX、磷[CCN] + TX、殺鼠酮 (1341) + TX、亞砷酸鉀 [CCN] + TX、滅鼠優 (1371) + TX、海蔥糖苷 (1390) + TX、亞砷酸鈉 [CCN] + TX、氰化鈉 (444) + TX、氟乙酸鈉 (735) + TX、士的寧 (745) + TX、硫酸銨 [CCN] + TX、殺鼠靈 (851) 以及磷化鋅 (640) + TX，

增效劑，該增效劑選自由以下物質組成的組：2-(2-丁氧基乙氧基)乙基胡椒基酯 (IUPAC 名稱) (934) + TX、5-(1,3-苯並二氧雜環戊烯-5-基)-3-己基環己-2-烯酮 (IUPAC 名稱) (903) + TX、具有橙花三級醇的法呢醇 (替代名稱) (324) + TX、MB-599 (發展代碼) (498) + TX、MGK 264 (發展代碼) (296) + TX、增效醚 (piperonyl butoxide) (649) + TX、增效醛 (piprotal) (1343) + TX、增效酯 (propyl isomer) (1358) + TX、S421 (發展代碼) (724) + TX、增效散 (sesamex) (1393) + TX、芝麻林素 (sesasmolin) (1394) 和亞砷 (1406) + TX，

動物驅避劑，該動物驅避劑選自由以下物質組成的組：蔥醌 (32) + TX、氯醛糖 (127) + TX、環烷酸銅 [CCN] + TX、王銅 (171) + TX、二氫吡農 (227) + TX、二環戊二烯 (化學名稱) (1069) + TX、雙胍鹽 (guazatine)

(422) + TX、雙胍醋酸鹽(422) + TX、滅蟲威(530) + TX、吡啶-4-胺(IUPAC 名稱)(23) + TX、塞侖(804) + TX、混殺威(trimethacarb)(840) + TX、環烷酸鋅[CCN]和福美鋅(856) + TX，

殺病毒劑，該殺病毒劑選自由以下物質組成的組：衣馬寧(替代名稱)[CCN] 和利巴韋林(替代名稱)[CCN] + TX，

創傷保護劑，該創傷保護劑選自由以下物質組成的組：氧化汞(512) + TX、辛噻酮(590)和甲基硫菌靈(802) + TX，

以及生物活性化合物，該等化合物選自由以下物質組成的組：阿紮康唑[60207-31-0] + TX、聯苯三唑醇[70585-36-3] + TX、糠菌唑[116255-48-2] + TX、環唑醇[94361-06-5] + TX、苯醚甲環唑[119446-68-3] + TX、烯唑醇[83657-24-3] + TX、氟環唑-[106325-08-0] + TX、腈苯唑[114369-43-6] + TX、氟啞唑[136426-54-5] + TX、氟矽唑[85509-19-9] + TX、粉唑醇[76674-21-0] + TX、己唑醇[79983-71-4] + TX、抑黴唑[35554-44-0] + TX、亞胺唑[86598-92-7] + TX、種菌唑[125225-28-7] + TX、葉菌唑[125116-23-6] + TX、腈菌唑[88671-89-0] + TX、稻瘟酯[101903-30-4] + TX、戊菌唑[66246-88-6] + TX、丙硫菌唑[178928-70-6] + TX、啞斑肱(pyriphenox)[88283-41-4] + TX、丙氯靈[67747-09-5] + TX、丙環唑[60207-90-1] + TX、矽氟唑(simeconazole)[149508-90-7] + TX、戊唑醇[107534-96-3] + TX、氟醚唑[112281-77-3] + TX、三唑酮[43121-43-3] + TX、三唑酮-[55219-65-3] + TX、氟菌唑[99387-89-0] + TX、滅菌唑[131983-72-7] + TX、三環苯嘧啶醇[12771-68-5] + TX、氯苯嘧啶醇[60168-88-9] + TX、氟氯苯嘧啶醇[63284-71-9] + TX、乙嘧酚磺酸酯(bupirimate)[41483-43-6] + TX、甲菌定(dimethirimol)[5221-53-4] + TX、

乙菌定 (ethirimol) [23947-60-6] + TX、十二環咪啉[1593-77-7] + TX、苯鏽啉 (fenpropidine) [67306-00-7] + TX、丁苯咪啉[67564-91-4] + TX、螺環菌胺 [118134-30-8] + TX、十三咪啉[81412-43-3] + TX、嘧菌環胺[121552-61-2] + TX、嘧菌胺[110235-47-7] + TX、嘧菌胺 (pyrimethanil) [53112-28-0] + TX、拌種咯[74738-17-3] + TX、咯菌腈 (fludioxonil) [131341-86-1] + TX、苯霜靈 (benalaxyl) [71626-11-4] + TX、呋霜靈 (furalaxyl) [57646-30-7] + TX、甲霜靈[57837-19-1] + TX、R 甲霜靈-[70630-17-0] + TX、呋醯胺[58810-48-3] + TX、惡霜靈 (Oxadixyl) [77732-09-3] + TX、苯菌靈[17804-35-2] + TX、多菌靈 [10605-21-7] + TX、咪菌威 (debacarb) [62732-91-6] + TX、麥穗寧[3878-19-1] + TX、噻苯達唑[148-79-8] + TX、乙菌利 (chlozoline) [84332-86-5] + TX、菌核利 (dichlozoline) [24201-58-9] + TX、異菌脲 (Iprodione) [36734-19-7] + TX、myclozoline[54864-61-8] + TX、腐菌利- (procymidone) [32809-16-8] + TX、乙烯菌核利 (vinclozoline)[50471-44-8] + TX、啞醯菌胺 (boscalid)[188425-85-6] + TX、萎鏽靈[5234-68-4] + TX、甲呋醯苯胺[24691-80-3] + TX、氟醯胺 (Flutolanil) [66332-96-5] + TX、滅鏽胺[55814-41-0] + TX、氧化萎鏽靈 [5259-88-1] + TX、吡噻菌胺 (penthioylrad) [183675-82-3] + TX、噻呋菌胺 [130000-40-7] + TX、雙胍鹽[108173-90-6] + TX、多果定 (dodine) [2439-10-3][112-65-2] (游離鹼) + TX、雙胍辛胺 (iminoctadine) [13516-27-3] + TX、嘧菌酯[131860-33-8] + TX、醚菌胺[149961-52-4] + TX、烯肟菌酯 {Proc.BCPC, Int. Congr., Glasgow. 2003, 1, 93} + TX、氟嘧菌酯[361377-29-9] + TX、甲基醚菌酯[143390-89-0] + TX、苯氧菌胺[133408-50-1] + TX、肟菌酯 [141517-21-7] + TX、肟醚菌胺[248593-16-0] + TX、啞氧菌酯[117428-22-5] +

TX、吡唑醚菌酯[175013-18-0] + TX、福美鐵[14484-64-1] + TX、代森錳鋅
 [8018-01-7] + TX、代森錳[12427-38-2] + TX、代森聯[9006-42-2] + TX、甲代
 森鋅 (propineb) [12071-83-9] + TX、塞命[137-26-8] + TX、代森鋅[12122-67-7]
 + TX、福美鋅[137-30-4] + TX、敵菌丹 (captafol) [2425-06-1] + TX、克菌丹
 [133-06-2] + TX、苯氟磺胺[1085-98-9] + TX、唑啉草 (fluoroimide) [41205-21-4]
 + TX、滅菌丹[133-07-3] + TX、甲苯氟磺胺[731-27-1] + TX、波爾多 (bordeaux)
 混合物[8011-63-0] + TX、氫氧化銅 (copperhydroxid) [20427-59-2] + TX、氯
 化銅 (copperoxychlorid) [1332-40-7] + TX、硫酸銅 (coppersulfat) [7758-98-7]
 + TX、氧化銅 (copperoxid) [1317-39-1] + TX、代森錳銅 (mancopper) [53988-93-5]
 + TX、喹啉銅 (oxine-copper) [10380-28-6] + TX、敵蟎普 (dinocap) [131-72-6]
 + TX、酞菌酯 (nitrothal-isopropyl) [10552-74-6] + TX、克瘟散[17109-49-8] +
 TX、異稻瘟淨 (iprobenphos) [26087-47-8] + TX、稻瘟靈 (isoprothiolane)
 [50512-35-1] + TX、氯瘟磷 (phosdiphen) [36519-00-3] + TX、克菌磷 (pyrazophos)
 [13457-18-6] + TX、甲基托氯磷 (tolclofos-methyl) [57018-04-9] + TX、苯並噻
 二唑- (acibenzolar-S-methyl) [135158-54-2] + TX、敵菌靈[101-05-3] + TX、苯
 噻菌胺[413615-35-7] + TX、滅瘟素 (blasticidin) -S[2079-00-7] + TX、滅蟎猛
 (chinomethionat) [2439-01-2] + TX、地茂散 (chloroneb) [2675-77-6] + TX、
 百菌清[1897-45-6] + TX、環氟菌胺[180409-60-3] + TX、霜脲氰[57966-95-7] +
 TX、二氯萘醌 (dichlone) [117-80-6] + TX、雙氯氰菌胺 (diclocymet)
 [139920-32-4] + TX、噻菌酮 (diclomezine) [62865-36-5] + TX、氯硝胺 (dicloran)
 [99-30-9] + TX、乙黴威 (diethofencarb) [87130-20-9] + TX、烯醯味啉
 [110488-70-5] + TX、SYP-LI90 (Flumorph) [211867-47-9] + TX、二噻農

(dithianon) [3347-22-6] + TX、噻唑菌胺 (ethaboxam) [162650-77-3] + TX、土菌靈 (etridiazole) [2593-15-9] + TX、惡唑菌酮 [131807-57-3] + TX、咪唑菌酮 (fenamidone) [161326-34-7] + TX、稻瘟醯胺 (Fenoxanil) [115852-48-7] + TX、三苯錫 (fentin) [668-34-8] + TX、嘧菌腈 (ferimzone) [89269-64-7] + TX、氟啶胺 (fluazinam) [79622-59-6] + TX、氟吡菌胺 (fluopicolide) [239110-15-7] + TX、磺菌胺 (flusulfamide) [106917-52-6] + TX、環醯菌胺 [126833-17-8] + TX、福賽得 (fosetyl-aluminium) [39148-24-8] + TX、惡黴靈 (hymexazol) [10004-44-1] + TX、丙森鋅 [140923-17-7] + TX、IKF-916 (賽座滅 (Cyazofamid)) [120116-88-3] + TX、春雷黴素 (kasugamycin) [6980-18-3] + TX、磺菌威 (methasulfocarb) [66952-49-6] + TX、苯菌酮 [220899-03-6] + TX、戊菌隆 (pencycuron) [66063-05-6] + TX、苯酞 [27355-22-2] + TX、多氧黴素 (polyoxins) [11113-80-7] + TX、噻菌靈 (probenazole) [27605-76-1] + TX、百維威 (propamocarb) [25606-41-1] + TX、碘啞唑酮 (proquinazid) [189278-12-4] + TX、樂啞酮 (pyroquilon) [57369-32-1] + TX、啞氧靈 [124495-18-7] + TX、五氯硝苯 [82-68-8] + TX、硫 [7704-34-9] + TX、噻醯菌胺 [223580-51-6] + TX、咪唑嗪 (triazoxide) [72459-58-6] + TX、三環唑 [41814-78-2] + TX、嗪胺靈 [26644-46-2] + TX、有效黴素 [37248-47-8] + TX、苯醯菌胺 (zoxamide) (RH7281) [156052-68-5] + TX、雙炔醯菌胺 (mandipropamid) [374726-62-2] + TX、吡蚜酮 (isopyrazam) [881685-58-1] + TX、塞德因 (sedaxane) [874967-67-6] + TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶-4-羧酸(9-二氯亞甲基-1,2,3,4-四氫-1,4-甲橋-萘-5-基)-醯胺 (揭露於 WO 2007/048556 中) + TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶-4-羧酸(3',4',5'-三氟-聯苯基-2-基)-醯胺 (揭露於 WO 2006/087343 中) + TX、

[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[(環丙基羰基)氧基]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氫-6,12-二羥基-4,6a,12b-三甲基-11-側氧基-9-(3-吡啶基)-2H,11H 萘並[2,1-b]呋喃並[3,4-e]呋喃-4-基]甲基-環丙甲酸酯 [915972-17-7] + TX 以及 1,3,5-三甲基-N-(2-甲基-1-氧丙基)-N-[3-(2-甲基丙基)-4-[2,2,2-三氟-1-甲氧基-1-(三氟甲基)乙基]苯基]-1H-吡唑-4-甲醯胺 [926914-55-8] + TX。

【0129】 因此，在實施方式 70 中，提供了殺有害生物組成物，該殺有害生物組成物包含至少一種根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物，或其農用化學上可接受的鹽或 N-氧化物，作為活性成分以及至少一種助劑。

【0130】 在實施方式 71 中，提供了根據實施方式 70 所述的組成物，該組成物進一步包含一種或多種殺昆蟲、殺蟎、殺線蟲和/或殺真菌的活性劑。

【0131】 此外，還提供了用於控制有害生物之方法，該方法包括將根據實施方式 70 或 71 所述的組成物施用於該等有害生物或其環境中，除了藉由手術或療法用於處理人或動物體的方法以及對於人或動物體實施的診斷方法之外。

【0132】 進一步提供了用於保護植物繁殖材料免受有害生物攻擊之方法，該方法包括用根據實施方式 70 或 71 所述的組成物處理該繁殖材料或該繁殖材料所種植的場所。

【0133】 還提供了包衣的植物繁殖材料，其中該植物繁殖材料的包衣包括如在實施方式 70 或 71 中任一項定義的化合物。

【0134】 在活性成分之後的括弧中的參考例如[3878-19-1]係指化學文摘的登記號。以上描述的混合配對物係已知的。當活性成分包括在“殺有害生物劑手冊(The Pesticide Manual)”[殺有害生物劑手冊-世界手冊(The Pesticide Manual - A World Compendium)；第十三版；編者：C.D.S.湯姆林(C. D. S. Tomlin)；英國農作物保護委員會(The British Crop Protection Council)]中時，它們在上文對於特定化合物在圓括號內給定的條目編號之下描述於該手冊中；例如，化合物“阿巴美丁”在條目編號(1)之下描述。當以上對具體的化合物加入“[CCN]”時，所討論的化合物包括在“殺有害生物劑通用名綱要(Compendium of Pesticide Common Names)”中，該綱要在互聯網上可得：[A. 伍德(Wood)；殺有害生物劑通用名綱要(Compendium of Pesticide Common Names)，版權©1995-2004]；例如化合物“乙醯蟲腈”在互聯網 <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html> 下進行了描述。

【0135】 上述的活性成分中大部分在上文是藉由所謂的“通用名”、相關的“ISO 通用名”或在個別情況下使用的另一個“通用名”來提及。如果名稱不是“通用名”，那麼對於特定化合物在圓括號內給出了作為代替而使用的該名稱的性質；在這種情況下，使用 IUPAC 名稱、IUPAC/化學文摘名稱、“化學名稱”、“傳統名稱”、“化合物名稱”、或“發展代碼”，或者如果既沒有使用該等名稱之一，也沒有使用“通用名”，那麼使用的是“別名”。“CAS 登記號”意指化學文摘登記號。

【0136】 根據實施方式 1 至 24 中任一項所述的化合物與上述活性成分的活性成分混合物包括根據實施方式 1 至 24 中任一項所述的化合物和上述活性成分，較佳的是處於從 100:1 至 1:6000 的混合比率，尤其是從 50:

1 至 1:50，更尤其是處於從 20:1 至 1:20 的比率，甚至更尤其從 10:1 至 1:10，非常尤其是從 5:1 和 1:5，尤其較佳的是從 2:1 至 1:2 的比率給出的，並且從 4:1 至 2:1 的比率同樣是較佳的，特別是處於 1:1，或 5:1，或 5:2，或 5:3，或 5:4，或 4:1，或 4:2，或 4:3，或 3:1，或 3:2，或 2:1，或 1:5，或 2:5，或 3:5，或 4:5，或 1:4，或 2:4，或 3:4，或 1:3，或 2:3，或 1:2，或 1:600，或 1:300，或 1:150，或 1:35，或 2:35，或 4:35，或 1:75，或 2:75，或 4:75，或 1:6000，或 1:3000，或 1:1500，或 1:350，或 2:350，或 4:350，或 1:750，或 2:750，或 4:750 的比率。那些混合比率係按重量計的。

【0137】 以上描述的混合物可以被用於控制有害生物的方法中，該方法包括將含如上描述的混合物的組成物施用於有害生物或其環境中，除了藉由手術或療法用於處理人或動物體的方法以及對於人或動物體實施的診斷方法。

【0138】 包含根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物以及一種或多種如以上描述的活性成分的混合物可以例如以單一的“摻水即用”的形式施用，以組合的噴霧混合物（該混合物由該等單一活性成分的單獨配製物構成）（例如“桶混製劑”）施用，並且當以順序的方式（即，一個在另一個適度短的時期（例如幾小時或幾天）之後）施用時組合使用該等單獨活性成分來施用。施用根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物和上述活性成分的順序對於實施本發明並不是至關重要的。

【0139】 根據本發明的該等組成物還可以包含其他固體或液體助劑，如穩定劑，例如未環氧化的或環氧化的植物油（例如環氧化的椰子油、

菜籽油或大豆油)，消泡劑（例如矽油），防腐劑，粘度調節劑，粘合劑和/或增粘劑；肥料或其他用於獲得特定效果的活性成分，例如殺細菌劑，殺真菌劑，殺線蟲劑，植物活化劑，殺軟體動物劑或除草劑。

【0140】 根據本發明的組成物係以本身已知的方式，在不存在助劑的情況下，例如藉由研磨、篩選和/或壓縮固體活性成分；和在至少一種助劑存在下，例如藉由透徹混合活性成分與一種或一些助劑和/或與一種或一些助劑一起研磨活性成分來製備。用於製備該等組成物的該等方法和用於製備該等組成物的化合物 I 的用途也是本發明的主題。

【0141】 該等組成物的施用方法，即是控制上述類型的有害生物的方法，如噴霧、霧化，撒粉，刷塗，包衣，撒播或澆灌-它們被選擇以適於普遍情況的預期目的-並且該等組成物用於控制上述類型的有害生物的用途係本發明的其他主題。典型的濃度量係在 0.1 與 1000 ppm 之間，較佳的是在 0.1 與 500 ppm 之間的活性成分。每公頃的施用量總體上是每公頃 1 到 2000 g 活性成分，尤其是 10 到 1000 g/ha，較佳的是 10 到 600 g/ha。

【0142】 在作物保護領域中，較佳的施用方法係施用至該等植物的葉（葉施藥），可能的是選擇施用的頻率和比率以符合所提及的有害生物的侵染風險。可替代地，該活性成分可以藉由根系統（內吸作用）到達植物，這係藉由用液體組成物將該等植物的所在地浸透或者藉由將固體形式的活性成分引入植物的所在地（例如引入土壤，例如以顆粒（土施）的形式）來實現的。在水稻作物的情況下，這樣的顆粒劑可以被計量地加入淹水的稻田中。

【0143】 本發明的該等化合物及其組成物還適合於植物繁殖材料的

保護（例如種子，像果實、塊莖或籽粒，或者苗圃植物）對抗上述類型的有害生物。可以用該化合物在種植前對該繁殖材料進行處理，例如可以在播種前對種子進行處理。可替代地，該化合物可以施用至種子籽粒（包衣），這係藉由將籽粒浸漬入液體組成物中或藉由施塗固體組成物層實現的。當該繁殖材料被種植在施用處時，還可能例如在條播期間將該等組成物施入種子犁溝。該等用於植物繁殖材料的處理方法和因此處理的植物繁殖材料係本發明另外的主題。典型的處理比率將取決於有待控制的植物以及有害生物/真菌，通常在每 100 kg 種子 1 克至 200 克之間，較佳的是在每 100 kg 種子 5 克至 150 克之間，例如在每 100 kg 種子 10 克至 100 克之間。

【0144】 術語種子包括所有種類的種子以及植物繁殖體，包括但並不限於真正的種子、種子塊、吸盤、穀粒、鱗莖、果實、塊莖、穀物、根莖、插條、切割枝條以及類似物並且在一個較佳的實施方式中是指真正的種子。

【0145】 本發明還包括經具有式 I 的化合物包衣或處理或含有根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物的種子。儘管取決於施用的方法成分的更多或更少的部分可以滲透到該種子材料中，術語“包衣或處理和/或含有”通常表示在施用的時候，在大多數情況下，該活性成分在該種子的表面。當所述種子產物（再）種植時，它可以吸收該活性成分。在實施方式中，本發明使得其上粘附有根據實施方式 1 至 69 中任一項的植物繁殖材料可得。此外，由此可得一種包括用根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物處理過的植物繁殖材料的組成物。

【0146】 種子處理包括本領域中已知的所有適合的種子處理技術，例如拌種、種子包衣、種子撒粉、浸種以及種子造粒。可以藉由任何已知的

方法實現根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物的種子處理施用，例如，在該等種子播種之前或播種/種植過程中對種子噴霧或藉由撒粉。

【0147】 根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物的殺有害生物/殺昆蟲特性可以經由以下試驗說明：

海灰翅夜蛾 (*Spodoptera littoralis*) (埃及棉葉蟲 (Egyptian cotton leaf worm))

將棉花葉圓片置於 24 孔微量滴定板中的瓊脂上並且用從 10'000 ppm DMSO 儲備溶液中製備的水性測試溶液進行噴霧。在乾燥之後，將葉圓片用五隻 L1 期幼蟲進行侵染。侵染 3 天之後，相對於未處理樣品，針對死亡率、拒食效果以及生長抑制評估樣品。測試樣品的海灰翅夜蛾的控制為在死亡率、拒食作用、以及生長抑制中的至少一種比未處理樣品更高時。以下化合物在 200 ppm 施用率下得到至少 80%的控制：1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、26、27、28、29、30、31、32、33、36、37、38、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、50、51、52、53、54 和 55。

小菜蛾 (*Plutella xylostella*) (小菜蛾 (Diamond back moth))：

將具有人工飼料的 24 孔微量滴定板用從 10'000 ppm DMSO 儲備溶液中製備的水性測試溶液藉由移液進行處理。在乾燥之後，用 L2 期幼蟲對各板進行侵染 (10 至 15 隻/孔)。侵染 5 天之後，相比於未處理樣品，針對死亡率和生長抑制對樣品進行評估。以下化合物在 200 ppm 施用率下給出了兩個類別 (死亡率或生長抑制) 中至少一個的至少 80%的效果：1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、

24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、36、37、38、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、50、51、52、53、54 和 55。

黃瓜條葉甲 (*Diabrotica balteata*) (玉米根蟲 (Corn root worm))

將 24 孔微量滴定板中的置於瓊脂層上的玉米芽用藉由噴霧從 10' 000 ppm DMSO 儲備溶液中製備的水性測試溶液進行處理。在乾燥之後，用 L2 期幼蟲對各板進行侵染(6 至 10 隻/孔)。侵染 4 天之後，相比於未處理樣品，針對死亡率和生長抑制對樣品進行評估。以下化合物在 200 ppm 施用率下給出了兩個類別（死亡率或生長抑制）中至少一個的至少 80%的效果：1、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、36、37、38、39、40、41、42、43、44、45、48、50、51、52、53、54 和 55。

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

將向日葵葉圓片置於 24 孔微量滴定板中的瓊脂上並且用從 10'000 ppm DMSO 儲備溶液中製備的水性測試溶液進行噴霧。在乾燥之後，將該等葉圓片用混合年齡的薊馬種群侵染。侵染 6 天之後，針對死亡率對該等樣品進行評估。以下化合物在 200 ppm 施用率下得到至少 80%的死亡率：1、3、4、5、6、9、10、11、12、14、16、17、18、20、21、22、24、27、29、30、31、32、33、36、37、38、42、43、44、45、48 和 50。

二點葉蟎 (*Ttranychus urticae*) (二斑葉蟎 (Two-spotted spider mite))：

將 24 孔微量滴定板中的瓊脂上的豆葉圓片用從 10'000 ppm DMSO 儲備溶液中製備的水性測試溶液進行噴霧。在乾燥之後，將該等葉圓片用混合年齡的蟎種群侵染。侵染 8 天之後，針對混合種群（流動平臺）的死亡率

對該等樣品進行評估。以下化合物在 200 ppm 施用率下得到至少 80% 的死亡率：1、3、4、5、6、7、9、10、11、12、13、15、17、19、20、22、23、26、27、28、29、30、31、33、35、36、37、38、39、42 和 43。

英雄美洲蟥(*Euschistus heros*)(新熱帶區褐蟥象(Neotropical Brown Stink Bug))

將 24 孔微量滴定板中的瓊脂上的大豆葉片用從 10' 000 ppm DMSO 儲備溶液中製備的水性測試溶液進行噴霧。在乾燥之後，用 N2 期若蟲對葉片進行侵染。侵染 5 天之後，相比於未處理樣品，針對死亡率和生長抑制對樣品進行評估。以下化合物在 200 ppm 施用率下給出了兩個類別（死亡率或生長抑制）中至少一個的至少 80% 的效果：3、4、5、6、9、10、12、14、15、16、17、18、20、24、27、28、29、31、32、33、36、37、38、42、43、45、50、52、53、54 和 55。

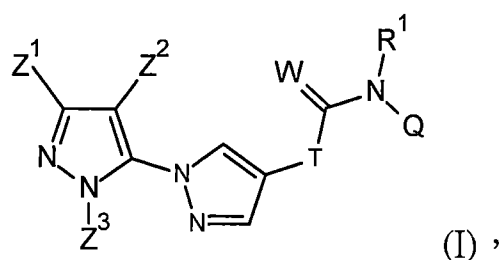
根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物與已知的化合物的區別可以在於在低施用率下更大的療效，這可以由熟習該項技術者使用以上概述的實驗程序，使用更低的施用率（如果必要的話）例如，50 ppm、12.5 ppm、6 ppm、3 ppm、1.5 ppm 或 0.8 ppm 來證實。

【符號說明】

無

申請專利範圍

1. 一種具有式 (I) 之化合物



其中

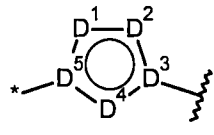
R^1 選自 H、 C_1 - C_6 -烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_3 - C_7 環烷基- C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基、芳基(C_0 - C_3)-烷基和雜芳基(C_0 - C_3)-烷基，其中每個 C_1 - C_6 -烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_3 - C_7 環烷基- C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基、芳基(C_0 - C_3)-烷基和雜芳基(C_0 - C_3)-烷基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、氰基、 C_1 - C_6 -烷氧基和 C_1 - C_6 -烷氧基羰基的取代基取代的；

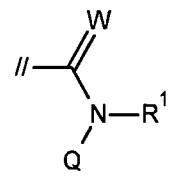
Q 選自 H、羥基、 $-C(=O)H$ 、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_3 - C_7 雜環烷基、 C_3 - C_7 環烷基- C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_3 -烷基- C_3 - C_7 環烷基、芳基(C_0 - C_3)-烷基、雜芳基(C_0 - C_3)-烷基、 N - C_1 - C_6 -烷基胺基、 N - C_1 - C_6 -烷基羰基胺基和 N,N -二(C_1 - C_6 -烷基)胺基，其中每個 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_3 - C_7 雜環烷基、 C_3 - C_7 環烷基- C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_3 -烷基- C_3 - C_7 環烷基、芳基(C_0 - C_3)-烷基、雜芳基(C_0 - C_3)-烷基、 N - C_1 - C_6 -烷基胺基、 N - C_1 - C_6 -烷基羰基胺基和 N,N -二(C_1 - C_6 -烷基)胺基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、羥基、硝基、胺基、氰基、 C_1 - C_6 -鹵烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基、 $-C(=O)OH$ 、 C_1 - C_6 -烷基胺基甲醯基、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=S)NH_2$ 、 C_3 - C_6 -環烷基胺基甲醯基

和苯基的取代基取代的；

W 係 O 或 S；

T 係具有下式的 5 員雜芳基



其中  表示到基團  的鍵；

並且*表示到該吡唑環的鍵；

D¹ 係選自 CR^{6a}、N、NR^{6b}、O 和 S；

D² 係選自 CR^{7a}、N、NR^{7b}、O 和 S；

D³ 係 C 或 N；

D⁴ 係選自 CR^{8a}、N、NR^{8b}、O 和 S；

D⁵ 係 C 或 N；

其條件係 D¹、D²、D³、D⁴ 和 D⁵ 中的至少一個係選自 N、O 和 S，D¹、D² 和 D⁴ 中的不多於一個係 O 或 S，D¹、D²、D³、D⁴ 和 D⁵ 中的不多於四個係 N，並且 D³ 和 D⁵ 不同時是 N；

R^{6a}、R^{7a} 和 R^{8a} 獨立地選自 H、鹵素、氰基、硝基、胺基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₃-C₇ 環烷基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-烷基氫硫基、C₁-C₆-烷基亞磺醯基和 C₁-C₆-烷基磺醯基，其中每個 C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₃-C₇ 環烷基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-烷基氫硫基、C₁-C₆-烷基亞磺醯基和 C₁-C₆-烷基磺醯基係未取代的或被 1 至 7 個鹵素取代的；

R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 獨立地選自 H 和 C_1-C_6 -烷基，其中 C_1-C_6 -烷基係未取代的或被 1 至 7 個鹵素取代的；

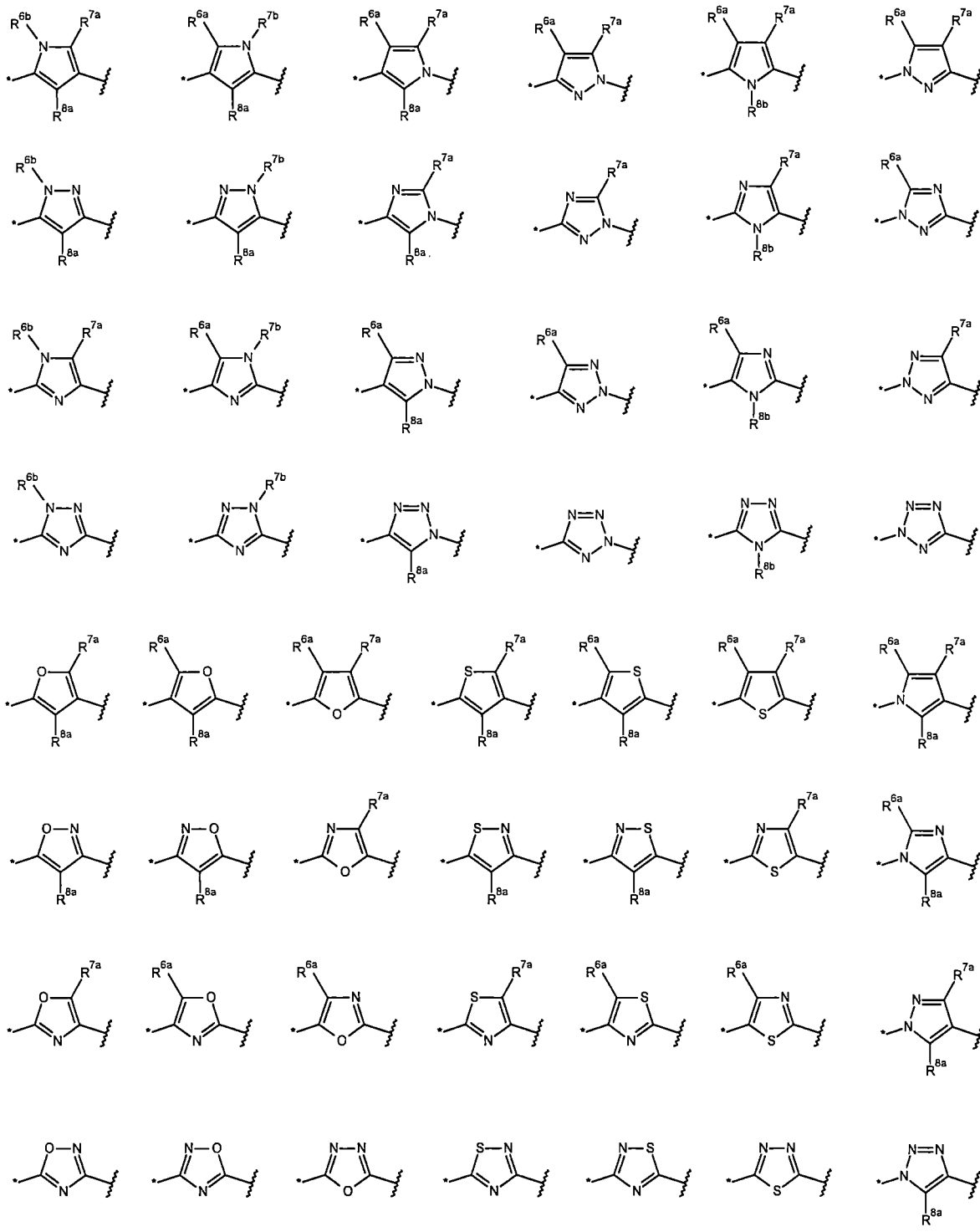
Z^1 選自 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷氧基、 C_3-C_7 雜環烷基、 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_6 -環烷基，其中每個 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷氧基、 C_3-C_7 雜環烷基、 C_1-C_6 -烷基和 C_3-C_6 -環烷基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、羥基、硝基、胺基、氰基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 -烷氧基羰基、 $-C(=O)OH$ 、 C_1-C_6 -烷基胺基甲醯基、 C_3-C_6 -環烷基胺基甲醯基和苯基的取代基取代的；

Z^2 選自 H、鹵素、氰基、硝基、胺基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_3-C_7 -雜環烷基、 C_3-C_7 -環烷基、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷基羰基、 C_1-C_6 -烷基氫硫基、 C_1-C_6 -烷基亞磺醯基和 C_1-C_6 -烷基磺醯基，其中每個 C_1-C_6 -烷氧基、 C_3-C_7 -雜環烷基、 C_3-C_7 -環烷基、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷基羰基、 C_1-C_6 -烷基氫硫基、 C_1-C_6 -烷基亞磺醯基和 C_1-C_6 -烷基磺醯基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、羥基、硝基、胺基、氰基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷氧基羰基、 $-C(=O)OH$ 、 C_1-C_6 -烷基胺基甲醯基、 C_3-C_6 -環烷基胺基甲醯基和苯基的取代基取代的；

Z^3 選自 H、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -環烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、芳基和雜芳基，其中每個 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -環烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、芳基和雜芳基，係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、羥基、硝基、胺基、氰基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷氧基羰基、 $-C(=O)OH$ 、 C_1-C_6 -烷基胺基甲醯基、 C_3-C_6 -環烷基胺基甲醯基和苯基的取代基取代的；

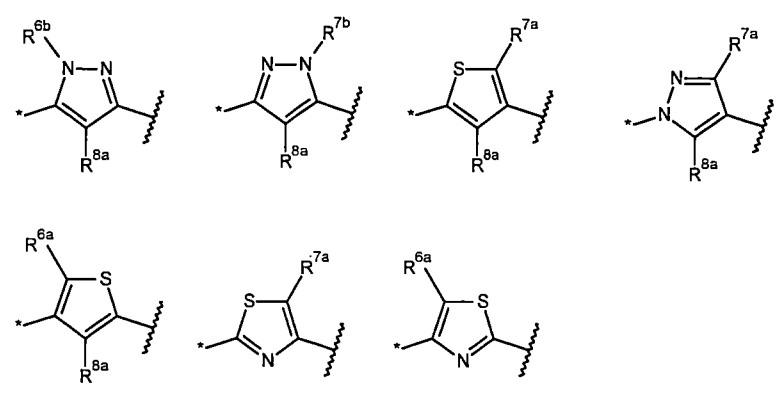
或其農用化學上可接受的鹽或 N-氧化物。

2. 如申請專利範圍第 1 項所述之化合物或鹽，其中 T 係選自



其中*表示到該吡啶基團的鍵。

3. 如申請專利範圍第 1 或 2 項所述之化合物或鹽，其中 T 係選自



其中*表示到該吡唑基團的鍵。

4. 如申請專利範圍第 1 至 3 項中任一項所述之化合物或鹽，其中

R¹ 係 H、甲基或乙基；

Q 係選自 1-氰基-環丙基、苄基、環丙基、2-噻吩基甲基、1-胺基硫代甲醯基環丙基、1-(C(=O)-NH₂)-環丙基、1-(C(=S)-NH₂)-環丙基、1-羥羰基-環丙基、吡啶-4-基、2,2,2-三氟乙基、甲基磺醯基、噻坦-3-基和 1-胺基甲醯基環丙基；

W 係 O；

如果存在的話，R^{6a}、R^{7a}和 R^{8a} 係獨立地選自 H、甲基、氯、溴、三氟甲基和三氟甲氧基；

如果存在的話，R^{6b}、R^{7b}和 R^{8b} 係獨立地選自 H 和甲基；

Z¹ 選自甲基、乙基、1,1-二甲基乙基、二氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、溴二氯甲基、1-氟乙基、1-氟-1-甲基乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,2,2,2-四氟乙基、1-氯-1,2,2,2-四氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、1,1-二氟乙基、五氟乙基、3,3,3,3,2,1,1-六氟丙氧基、2-三氟甲氧基-2,1,1-三氟乙氧基、七氟-正丙基、七氟-異丙基、九氟-正丁基、環丙基、1-氯環丙基、1-氟

環丙基、1-溴環丙基、1-氰基-環丙基、1-三氟甲基-環丙基、環丁基和 2,2-二氟-1-甲基-環丙基；

Z^2 係選自 H、鹵素、氰基、硝基、胺基、甲基、乙基、1,1-二甲基乙基、二氟甲基、三氟甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、溴二氯甲基、1-氟乙基、1-氟-1 甲基乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,2,2,2-四氟乙基、1-氯-1,2,2,2-四氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、1,1-二氟乙基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、五氟乙基、七氟-正丙基、七氟-異丙基、九氟-正丁基、甲基氫硫基、甲基亞磺醯基、甲基磺醯基、乙硫基、乙基亞磺醯基、乙基磺醯基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、氯-二氟甲基氫硫基、氯-二氟甲基亞磺醯基、氯-二氟甲基磺醯基、二氯-氟甲基氫硫基、二氯-氟甲基亞磺醯基、二氯-氟甲基磺醯基；並且

Z^3 係選自 H、甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、二級丁基、三級丁基、乙烯基、1-丙烯基、1-丙炔基、1-丁炔基、二氟甲基、三氟甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、1 氟-1-甲基乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、苯基、2-氯苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、2,5-二氯苯基、3,4-二氯苯基、2,6-二氯苯基、2,6-二氯-4-三氟甲基苯基、3-氯-5-三氟甲基吡啶-2-基、4-NO₂-苯基和 3-氯-吡啶-2-基。

5. 如申請專利範圍第 1 至 3 項中任一項所述之化合物或鹽，其中

R^1 係 H、甲基或乙基；

Q 係選自環丙基、1-氰基-環丙基、1-(C(=O)-NH₂)-環丙基、

1-(C(=S)-NH₂)-環丙基、1-(三氟甲基)-環丙基、2-氟-環丙基和 2-(三氟甲基)-環丙基；

W 係 O；

如果存在的話，R^{6a}、R^{7a}和 R^{8a}係獨立地選自 H、氯、溴、氟、甲基、三氟甲基、甲氧基和氰基；

如果存在的話，R^{6b}、R^{7b}和 R^{8b}係獨立地選自 H 和甲基；

Z¹係選自 C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵烷氧基和 C₁-C₆-鹵烷基
其中每個 C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵烷氧基和 C₁-C₆-鹵烷基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、C₁-C₆-烷氧基和 C₁-C₆-鹵烷氧基的取代基取代的；

Z²係選自 C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷基，其中每個 C₁-C₆-烷氧基和 C₁-C₆-烷基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素的取代基取代的；

Z³係選自甲基、乙基、環丙基、正丙基和 H。

6. 如申請專利範圍第 1 至 3 項中任一項所述之化合物或鹽，其中

R¹係 H、甲基或乙基；

Q 係選自環丙基、1-氰基-環丙基、2-氟-環丙基和 2-(三氟甲基)-環丙基；

W 係 O；

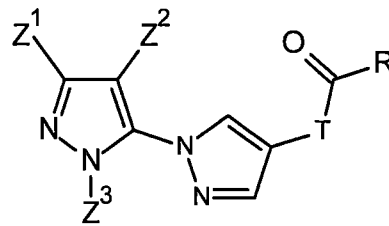
如果存在的話，R^{6a}、R^{7a}、R^{8a}、R^{6b}、R^{7b}和 R^{8b}係獨立地選自 H、氯、氟、甲基、三氟甲基、甲氧基和氰基；

Z¹係 CF₂CF₃、-OCF₂CF₂CF₃或-OCF₂CFOCF₃；

Z²係 CF₃、或 OCF₂H；

Z^3 係甲基。

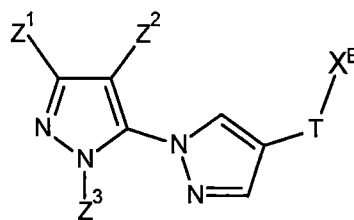
7. 一種具有式 (II) 之化合物



(II)

其中 T、 Z^1 、 Z^2 和 Z^3 係如申請專利範圍第 1 至 6 項中任一項定義的，
並且 R 係選自 OH、 C_1 - C_6 烷氧基、Cl、F 和 Br。

8. 一種具有式 (III) 之化合物



(III)

其中 T、 Z^1 、 Z^2 和 Z^3 係如申請專利範圍第 1 至 6 項中任一項定義的，
並且 X^B 係適合的離去基團，特別是 Cl、Br、F 和 I。

9. 一種殺有害生物組成物，該殺有害生物組成物包含至少一種如申請專利範圍第 1 至 6 項中任一項所述之化合物，或其農用化學上可接受的鹽或 N-氧化物，作為活性成分以及至少一種助劑。
10. 如申請專利範圍第 9 項所述之組成物，該組成物進一步包含一種或多種其他殺昆蟲、殺蟎、殺線蟲和/或殺真菌的活性劑。
11. 一種用於控制有害生物之方法，該方法包括將如申請專利範圍第 9 或 10 項所述之組成物施用於該等有害生物或其環境中，除了藉由手術或

療法用於處理人或動物體的方法以及對於人或動物體實施的診斷方法之外。

12. 一種用於保護植物繁殖材料免受有害生物攻擊之方法，該方法包括用如申請專利範圍第 9 或 10 項所述之組成物處理該繁殖材料或該繁殖材料所種植之場所。
13. 一種包衣的植物繁殖材料，其中該植物繁殖材料的包衣包括如在申請專利範圍第 1 至 6 項中任一項定義之化合物。

發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動)

【發明名稱】(中文/英文)

殺有害生物活性吡唑衍生物

Pesticidally active pyrazole derivatives

【技術領域】

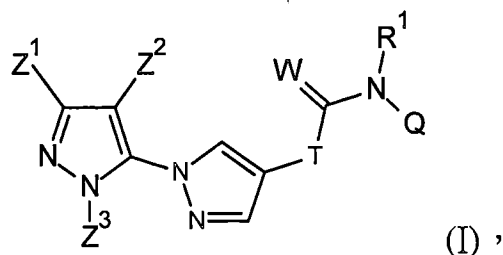
【0001】 本發明涉及吡唑衍生物，涉及用於製備它們的方法，涉及用於製備它們的中間體，涉及包括那些衍生物的殺有害生物組成物，尤其是殺昆蟲的、殺蟎的、殺軟體動物的以及殺線蟲的組成物，並且涉及使用它們來防治與控制有害生物例如昆蟲、蟎、軟體動物以及線蟲有害生物之方法。

【先前技術】

【0002】 現在已經出人意料地發現某些吡唑衍生物具有高度有效的殺昆蟲特性。在該範圍內的其他化合物係從 WO 2014/122083、WO 2012/107434、WO 2015/067646、WO 2015/067647、WO 2015/067648、WO 2015/150442、WO 2015/193218 和 WO 2010/051926 已知的。

【發明內容】

【0003】 因此，作為實施方式 1，本發明涉及具有式 (I) 之化合物，



其中

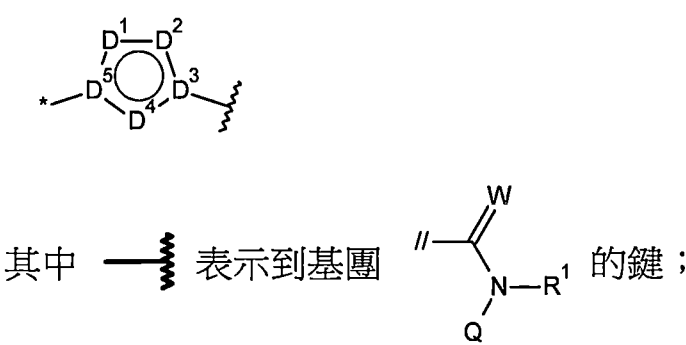
R¹ 選自 H、C₁-C₆-烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₃-C₇環烷

基-C₁-C₃-烷基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基、芳基(C₀-C₃)-烷基和雜芳基(C₀-C₃)-烷基，其中每個 C₁-C₆-烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₃-C₇環烷基-C₁-C₃-烷基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基、芳基(C₀-C₃)-烷基和雜芳基(C₀-C₃)-烷基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、氰基、C₁-C₆-烷氧基和 C₁-C₆-烷氧基羰基的取代基取代的；

Q 選自 H、羥基、-C(=O)H、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₃-C₇雜環烷基、C₃-C₇環烷基-C₁-C₃-烷基、C₁-C₃-烷基-C₃-C₇環烷基、芳基(C₀-C₃)-烷基、雜芳基(C₀-C₃)-烷基、*N*-C₁-C₆-烷基胺基、*N*-C₁-C₆-烷基羰基胺基和 *N,N*-二(C₁-C₆-烷基)胺基，其中每個 C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₃-C₇雜環烷基、C₃-C₇環烷基-C₁-C₃-烷基、C₁-C₃-烷基-C₃-C₇環烷基、芳基(C₀-C₃)-烷基、雜芳基(C₀-C₃)-烷基、*N*-C₁-C₆-烷基胺基、*N*-C₁-C₆-烷基羰基胺基和 *N,N*-二(C₁-C₆-烷基)胺基係未取代的或被 1 至 7 個獨立地選自鹵素、羥基、硝基、胺基、氰基、C₁-C₆-鹵烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷氧基羰基、-C(=O)OH、C₁-C₆-烷基胺基甲醯基、-C(=O)NH₂、-C(=S)NH₂、C₃-C₆-環烷基胺基甲醯基和苯基的取代基取代的；

W 係 O 或 S；

T 係具有下式的 5 員雜芳基



氮雜環己基、氮雜環庚基、側氧基吡咯啉基、二側氧基吡咯啉基、側氧基咪啉基、側氧基哌啉基和氧雜環庚基。

【0044】 特別重要的是雜芳基，即雜芳香族系統。

【0045】 術語“雜芳基”表示雜芳香族基團，即完全不飽和的芳香族雜環基團，其落入上述雜環的定義中。“雜芳基”，具有 5 至 7 員環，該等環具有 1 至 3 個、較佳的是 1 或 2 個相同或不同的選自 N、O 和 S 的雜原子。“雜芳基”的實例係呋喃基，噻吩基，吡啶基，咪唑基，1,2,3-和 1,2,4-三唑基，異噻唑基，噻唑基，異噻唑基，1,2,3-、1,3,4-、1,2,4-和 1,2,5-噁二唑基，氮呋基，吡咯基，吡啶基，噻吩基，噻唑基，1,3,5-、1,2,4-和 1,2,3-三噻吩基，1,2,4-、1,3,2-、1,3,6-和 1,2,6-噁噻吩基，氧雜環庚三烯基，硫雜環庚三烯基，1,2,4-三唑酮基和 1,2,4-二氮呋基。

【0046】 根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物，該化合物具有至少一個鹼性中心，可以與以下酸形成例如酸加成鹽，該等酸為：例如強無機酸（例如礦物酸，例如高氯酸、硫酸、硝酸、亞硝酸、磷酸或氫鹵酸），強有機羧酸（例如未取代的或像被鹵素取代的 C_1 - C_4 烷羧酸，例如乙酸（像飽和或不飽和的二羧酸），例如草酸、丙二酸、琥珀酸、馬來酸、富馬酸或鄰苯二甲酸（像羧基羧酸），例如抗壞血酸、乳酸、蘋果酸、酒石酸或檸檬酸，或像苯甲酸），或有機磺酸（例如未經取代的或像被鹵素取代的 C_1 - C_4 烷-或芳基磺酸，例如甲烷-或對甲苯磺酸）。根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物，該化合物具有至少一個鹼性中心，可以例如與鹼形成鹽，例如礦物鹽，例如鹼金屬或鹼土金屬鹽，例如鈉鹽、鉀鹽或鎂鹽；或與氨或有機胺形成鹽，該有機胺為例如咪啉、哌啶、吡咯啉、單、二或三

低碳數烷基胺，例如乙胺、二乙胺、三乙胺或二甲基丙基胺，或單、二或三羥基低碳數烷基胺，例如單乙醇胺、二乙醇胺或三乙醇胺。

【0047】 根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物還包括在鹽形成的過程中可以形成的水合物。

【圖式簡單說明】

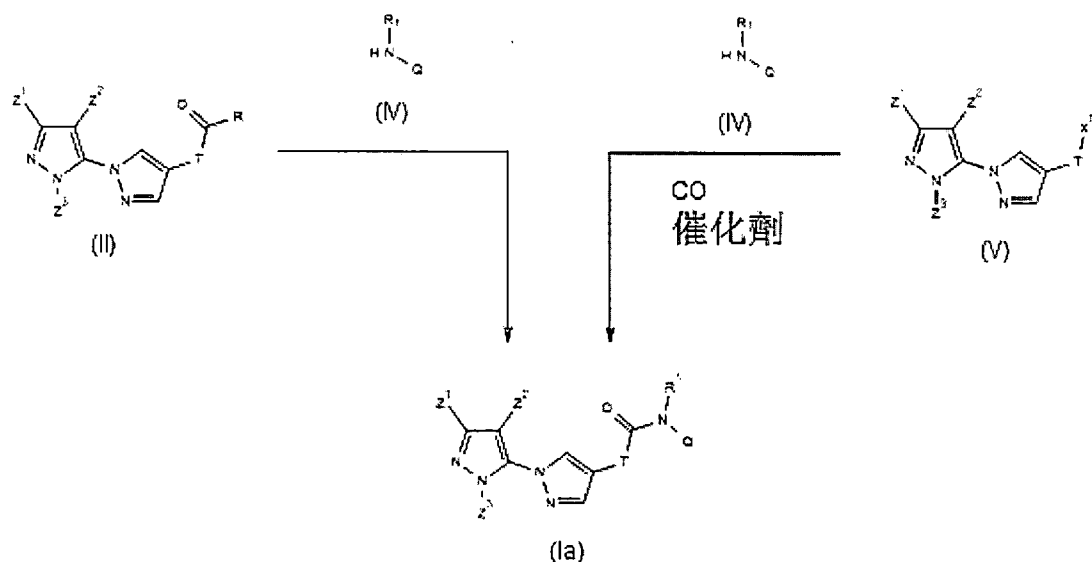
無

【實施方式】

【0048】 根據實施方式 1 至 69 中任一項所述的化合物可以由熟習該項技術者熟知的多種方法或如在流程 1 至 4 中所示的製造。關於該製備的另外說明可在 WO 2015/067646、WO 2014/122083 和 WO 2012/107434 中找到。

【0049】 具有式 (I) 之化合物可以，例如，根據流程 1 至 4 製備。

流程 1：



其中 Z¹、Z²、Z³、R¹、Q 和 T 係如在實施方式 1 至 69 中任一項定義的。

1) 如流程 1 中所示的，具有式 (Ia) 之化合物可以藉由將具有式 (II) 之化合物（其中 R 為 OH、C₁-C₆烷氧基或 Cl，F 或 Br）與具有式 (IV) 之胺進