

發明專利說明書

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※ 申請案號： 97141153

※ 申請日期： 97.10.27

※IPC 分類：

A01N 43/50 (2006.01)

A01P 7/02 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

A01P 5/00 (2006.01)

A01P 9/00 (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

化學化合物

CHEMICAL COMPOUNDS

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

先正達合夥公司

SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

代表人：(中文/英文)

1. 喬瑟琳 塞若尼 / CERONI, JOCELYNE

2. 寇尼里亞 史基勒 / SCHILLER, CORNELIA

住居所或營業所地址：(中文/英文)

瑞士，4058 巴賽爾城，黑森林大道 215 號

Schwarzwaldallee 215, 4058 Basel, Switzerland

國 籍：(中文/英文)

瑞士 / Switzerland

三、發明人：(共 4 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 克利斯塔弗 路西 / LUETHY, Christoph

2. 安東尼 柯尼利爾斯 歐蘇利文 / O'SULLIVAN, Anthony Cornelius

3. 湯瑪士 披特爾納 / PITTERNA, Thomas

4. 傑根 哈利 史蓋特 / SCHAETZER, Jürgen Harry

國 籍：(中文/英文)

1. 瑞士 / Switzerland

200924646

2. 英國 / U.K.
3. 奧地利 / Austria
4. 德國 / Germany

四、聲明事項：

☐ 主張專利法第二十二條第二項☐第一款或☐第二款規定之事實，其事實發生日期為： 年 月 日。

☒ 申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

☒ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

英國專利 、 2007.11.07 、 0721850.6

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

九、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於新穎咪唑啉衍生物以及其作為殺昆蟲劑、殺蟎劑、殺軟體動物劑和殺線蟲劑的用途。本發明亦關於包括此等咪唑啉衍生物的殺昆蟲和殺蟎、殺軟體動物和殺線蟲的組合物，以及使用此等衍生物及/或組合物對抗和控制昆蟲、蟎、軟體動物和線蟲的有害生物方法。

【先前技術】

許多咪唑啉衍生物係習知的；例如歐洲專利申請案 EP0423802 敘述芳基氧基芳基咪唑啉作為醫藥用途。Moormann 等人(1990 J. Med Chem 33:614-626)敘述 2-[(芳基氧基)烷基]咪唑啉係為有潛力的止瀉藥，以及揭示化合物 3-(4,5-二氫-1H-咪唑-2-基)-3-(2,6-二甲基-苯氧基)-丙-1-醇。

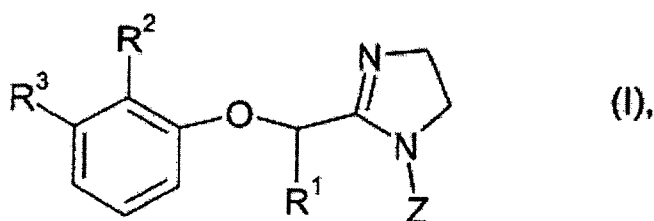
用於對抗體外寄生生物(ectoparasite)及/或蟎類的芳基氧基甲基咪唑啉係為此技藝所習知者，例如參考美國專利第 5,128,361，美國專利第 4,226,876，美國專利第 4,414,223，DE 2818367，EP 0011596，美國專利第 4,276,302，美國專利第 4,232,011，美國專利第 4,241,075，美國專利第 4,233,306。然而，以上所揭示的化合物無一者顯示在苯基環位置 3 具鹵烷基以及芳基氧基與咪唑啉環之間具支鏈伸烷基的化合物。

日本專利申請案 JP 51106739 敘述具殺蟎和殺昆蟲活

性的特定芳基氧基甲基咪唑啉。

【發明內容】

吾人頃發現另外的新穎咪唑啉衍生物，其具備令人驚訝的優良殺害活性，特別是令人驚訝的優良殺昆蟲和殺蟎活性。因此，根據本發明第一內容係提供一種式(I)化合物：



或其鹽類或 N-氧化物，其中

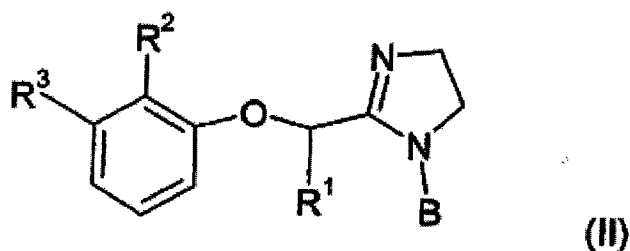
R^1 為 C_{1-10} 烷基；

R^2 為 C_{1-5} 烷基， C_{1-5} 鹵烷基， C_{1-5} 羥基烷基， C_{2-5} 烯基， C_{2-5} 鹵烯基， C_{2-5} 炔基， C_{3-6} 環烷基， C_{1-5} 烷氧基， C_{1-5} 鹵烷氧基， C_{1-3} 烷氧基(C_{1-3} 烷基)， C_{1-3} 烷氧基(C_{2-3})烯基， C_{1-5} 烷基硫基， C_{1-5} 鹵烷基硫基， C_{1-5} 烷基亞磺基， C_{1-5} 烷基磺基，氰基，硝基，甲酯基，或 $-CH=N-R^{18}$ 基團，其中 R^{18} 為羥基或 C_{1-3} 烷氧基；

R^3 為 C_{1-5} 鹵烷基；

Z 為氫，羥基，硝基，氰基，羅丹諾基(rhodano)，甲酯基，G-，G-S-，G-S-S-，G-A-， R^7R^8N -， R^7R^8N -S-， R^7R^8N -A-，G-O-A-，G-S-A-， $(R^{10}O)(R^{11}O)P(X)$ -， $(R^{10}O)(R^{11}S)P(X)$ -， $(R^{10}O)(R^{11})P(X)$ -， $(R^{10}S)(R^{11}S)P(X)$ -， $(R^{10}O)(R^{14}R^{15}N)P(X)$ -， $(R^{11})(R^{14}R^{15}N)P(X)$ -， $(R^{14}R^{15}N)(R^{16}R^{17}N)P(X)$ -，G-N=CH-，G-O-N=CH-， $N \equiv C-N=CH$ -，或

Z 為下式 (II) 基團



其中 B 為 S-，S-S-，S(O)-，C(O)-，或 (CH₂)_n-，n 為 1 至 6 的整數；R¹，R² 和 R³ 定義如上，以及

G 為視需要經取代的 C₁₋₁₀ 烷基，視需要經取代的 C₂₋₁₀ 烯基，視需要經取代的 C₂₋₆₀ 炔基，視需要經取代的 C₃₋₇ 環烷基，視需要經取代的 C₃₋₇ 環烯基，視需要經取代的芳基，視需要經取代的雜芳基或視需要經取代的雜環基；

A 為 S(O)，SO₂，C(O) 或 C(S)；

R⁷ 和 R⁸ 係獨立地為氫或 G；或 R⁷ 和 R⁸ 係一起與其所連接的 N 原子形成 N=CR¹²R¹³ 基團；或 R⁷ 和 R⁸ 係一起與其所連接的 N 原子形成 5、6 或 7 員雜環狀環，其雜環狀環視需要包含一或二個另外的選自 O、N 或 S 的雜原子，且係視需要經一或二個 C₁₋₆ 烷基所取代；

R¹⁰ 和 R¹¹ 係獨立地為 C₁₋₆ 烷基，苄基或苯基，其中苯基視需要經鹵素，硝基，氰基，C₁₋₃ 烷基，C₁₋₃ 鹵烷基，C₁₋₃ 烷氧基，C₁₋₃ 鹵烷氧基；

R¹²，R¹³，R¹⁴，R¹⁵，R¹⁶ 及 R¹⁷ 係獨立地為氫或 C₁₋₆ 烷基；

X 為 O 或 S。

為了避免疑問，本文所用“化合物”用語包括所有該化合

物的鹽類和 N-氧化物，即使不經明確地陳述。

本文所述的式(I)化合物可能以不同幾何或光學異構物或不同互變異構物形式存在。可能存在一或多個對掌中心，例如在對掌碳原子 CHR^1 或基團 G 中的對掌碳單位，或對掌-S(O)-單位，其中在此情況下，式(I)化合物可能以純對映異構物，對映異構物混合物，純非對映異構物或非對映異構物混合物。分子內可能存在雙鍵，例如 $\text{C}=\text{C}$ 或 $\text{C}=\text{N}$ 鍵，其中在此情況下，式(I)化合物係以單一異構物或異構物混合物存在。可能存在互變異構作用中心。本發明涵蓋所有此類異構物以及互變異構物以及其所有比例的混合物，以及同位素形式，例如氘化化合物。

適宜的酸式加成鹽包括該等連同無機酸（例如氫氯酸、氫溴酸、硫酸、硝酸與磷酸）或有機羧酸（例如草酸、酒石酸、乳酸、丁酸、甲基苯甲酸、己酸與鄰苯二甲酸）或是磺酸（例如甲磺酸、苯磺酸與甲苯磺酸）之鹽。有機羧酸的其他例子包括有鹵代酸，例如三氟乙酸。

N-氧化物是三級胺的氧化形式或是含氮雜芳化合物的氧化形式。N-氧化物在許多書籍當中有說明，舉例來說，說明於 Angelo Albini 與 Silvio Pietra 所著之 "Heterocyclic N-oxides," CRC Press, Boca Raton, Florida, 1991。

為了避免疑問，除非本文特定地指出基團係為“視需要經取代”或明確被取代，應理解該基團係為未經取代。

各烷基部分—單獨抑或是作為較大型基團（例如烷氧基、烷氧基羰基、烷基羰基、烷基胺基羰基、二烷基胺基

羰基)的一部分一係為直鏈或支鏈且為，舉例來說，甲基、乙基、正丙基、正丁基、正戊基、正己基、異丙基、正丁基、二級丁基、異丁基、三級丁基或新戊基。烷基基團係適宜為 C_1 至 C_{10} 烷基基團，但較佳為 C_1 - C_8 烷基基團，更佳為 C_1 - C_6 烷基基團，且最佳為 C_1 - C_4 烷基基團。

形成環或鏈的伸烷基、伸烯基及伸炔基基團可視需要的地進一步被一或多個鹵素、 C_1 - C_3 烷基及/或 C_1 - C_3 烷氧基基團取代。

若出現時，位在烷基部分（單獨抑或是作為較大型基團的一部分）上的視需要的取代基係包括下列當中的一或多者：鹵素、硝基、氰基、硫氰基、異硫氰基、 C_{3-7} 環烷基（其本身係視需要的地被 C_{1-6} 烷基或鹵素取代）、 C_{5-7} 環烯基（其本身係視需要的地被 C_{1-6} 烷基或鹵素取代）、羥基、 C_1 - C_{10} 烷氧基、 C_1 - C_{10} 烷氧基(C_{1-10})烷氧基、三(C_{1-4})烷基甲矽烷基(C_{1-6})烷氧基、 C_{1-6} 烷氧基羰基(C_{1-10})烷氧基、 C_{1-10} 鹵烷氧基、芳基(C_{1-4})-烷氧基（其中芳基基團係經視需要的地取代）、 C_{3-7} 環烷基氧基（其中環烷基基團係視需要的地被 C_{1-6} 烷基或鹵素取代）、 C_{2-10} 烯基氧基、 C_{2-10} 炔基氧基、SH、 C_{1-10} 烷基硫基、 C_{1-10} 鹵烷基硫基、芳基(C_{1-4})烷基硫基（其中芳基基團係經視需要的地取代）、 C_{3-7} 環烷基硫基（其中環烷基基團係視需要的地被 C_{1-6} 烷基或鹵素取代）、三(C_{1-4})烷基甲矽烷基(C_{1-6})烷基硫基、芳基硫基（其中芳基基團係經視需要的地取代）、 C_{1-6} 烷基磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷基磺醯基、 C_{1-6} 烷基亞磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷基亞磺醯基、芳基磺醯

基（其中芳基基團可被視需要的地取代）、三(C₁₋₄)烷基甲矽烷基、芳基二(C₁₋₄)烷基甲矽烷基、(C₁₋₄)烷基二芳基甲矽烷基、三芳基甲矽烷基、甲醯基、C₁₋₁₀ 烷基羰基、羥基羰基、C₁₋₁₀ 烷氧基羰基、胺基羰基、C₁₋₆ 烷基胺基羰基、二(C₁₋₆ 烷基)胺基羰基、N-(C₁₋₃ 烷基)-N-(C₁₋₃ 烷氧基)胺基羰基、C₁₋₆ 烷基羰基氧基、芳基羰基氧基（其中芳基基團係經視需要的地取代）、(C₁₋₆)烷基胺基羰基氧基、二(C₁₋₆)烷基胺基羰基氧基、肟與肟醚，例如=NOC₁₋₆ 烷基、=NO 鹵 C₁₋₆ 烷基與=NO C₁₋₂ 芳基（其本身係經視需要的地取代）、芳基（其本身係經視需要的地取代）、雜芳基（其本身係經視需要的地取代）、雜環基（其本身係視需要的地被 C₁₋₆ 烷基或鹵素取代）、芳基氧基（其中芳基基團係經視需要的地取代）、雜芳基氧基（其中雜芳基基團係經視需要的地取代）、雜環基氧基（其中雜環基基團係視需要的地被 C₁₋₆ 烷基或鹵素取代）、胺基、C₁₋₆ 烷基胺基、二(C₁₋₆)烷基胺基、C₁₋₆ 烷基羰基胺基、(C₁₋₆)烷基羰基-N-(C₁₋₆)烷基胺基、C₂₋₆ 烯基羰基、C₂₋₆ 炔基羰基、C₃₋₆ 烯基氧基羰基、C₃₋₆ 炔基氧基羰基、芳基氧基羰基（其中芳基基團係經視需要的地取代）及芳基羰基（其中芳基基團係經視需要的地取代）。

烯基與炔基部分可為直鏈或支鏈形式，而烯基部分—適當的話—可呈（E）-或（Z）-構形。例子有乙烯基、烯丙基與炔丙基。烯基與炔基部分可含有呈任何組合之一或多個雙鍵及/或參鍵。可理解到的是丙二烯基與炔基烯基係包括在該等用詞內。

若出現時，位在烯基或炔基上的視需要的取代基係包括該等上文提及烷基部分時所給定的視需要的取代基。

在本說明書上下文中，鹽基為經視需要的地取代之 C_{1-6} 烷基羰基（舉例來說：乙鹽基）、經視需要的地取代之 C_{2-6} 烯基羰基、經視需要的地取代之 C_{3-6} 環烷基羰基（舉例來說：環丙烷基羰基、經視需要的地取代之 C_{2-6} 炔基羰基、經視需要的地取代之芳基羰基（舉例來說：苯甲鹽基）或是經視需要的地取代之雜芳基羰基（例如菸鹼鹽基或異菸鹼鹽基）。

鹵素為氟、氯、溴或碘。

鹵烷基是被一或多個相同或不同的鹵素原子取代的烷基且為，舉例來說， CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_2H 、 CCl_2CH 、 FCH_2 、 $ClCH_2$ 、 $BrCH_2$ 、 CH_3CHF 、 CF_3CH_2 或 CHF_2CH_2 。

鹵烯基基團是取代有一或多個相同或不同鹵素原子的烯基基團。

在本說明書上下文中，「芳基」、「芳環」及「芳環系統」等用詞指的是可為單-、二-或是三環的環系統。該類環的例子包括了苯基、萘基、蒽基、茚基或菲基。較佳的芳基基團是苯基。此外，「雜芳基」、「雜芳環」或是「雜芳環系統」等用詞指的是含有至少一個雜原子並由單一環構成抑或由二或多個稠合環構成的芳環系統。較佳地，單一環係含有至多三個而雙環系統係含有至多四個較佳選自於氮、氧與硫的雜原子。該類基團的例子包括有呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、1,2,3-三唑基、1,2,4-

三唑基、噁唑基、異噁唑基、噻唑基、異噻唑基、1,2,3-噁二唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,5-噁二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,2,5-噻二唑基、吡啶基、嘧啶基、噻吩基、吡吩基、1,2,3-三吩基、1,2,4-三吩基、1,3,5-三吩基、苯并呋喃基、苯并異呋喃基、苯并噻吩基、苯并異噻吩基、吡啶基、異吡啶基、吡啶基、苯并噻唑基、苯并異噻唑基、苯并噁唑基、苯并異噁唑基、苯并咪唑基、2,1,3-苯并噁二唑、喹啉基、異喹啉基、噌啉基、吡吩基、喹啉基、喹啉基、茶啶基、苯并三吩基、嘌呤基、喋啶基以及吡吩基。雜芳基的較佳例子係包括吡啶基、嘧啶基、三吩基、噻吩基、呋喃基、噁唑基、異噁唑基、2,1,3-苯并噁二唑及噻唑基。

若出現時，位在芳基或雜芳基上的視需要的取代基係分別選自於鹵素、硝基、氰基、硫氰基、異硫氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基-(C_{1-6})烷基、 C_{2-6} 烯基、 C_{2-6} 鹵烯基、 C_{2-6} 炔基、 C_{3-7} 環烷基（其本身係視需要的地被 C_{1-6} 烷基或鹵素取代）、 C_{5-7} 環烯基（其本身係視需要的地被 C_{1-6} 烷基或鹵素取代）、羥基、 C_{1-10} 烷氧基、 C_{1-10} 烷氧基(C_{1-10})烷氧基、三(C_{1-4})烷基-甲矽烷基(C_{1-6})烷氧基、 C_{1-6} 烷氧基羰基(C_{1-10})烷氧基、 C_{1-10} 鹵烷氧基、芳基(C_{1-4})烷氧基（其中芳基基團係視需要的地被鹵素或 C_{1-6} 烷基取代）、 C_{3-7} 環烷基氧基（其中環烷基基團係視需要的地被 C_{1-6} 烷基或鹵素取代）、 C_{2-10} 烯基氧基、 C_{2-10} 炔基氧基、SH、 C_{1-10} 烷基硫基、 C_{1-10} 鹵烷基硫基、芳基(C_{1-4})烷基硫基 C_{3-7} 環烷

基硫基（其中環烷基基團係視需要的地被 C_{1-6} 烷基或鹵素取代）、三(C_{1-4})-烷基甲矽烷基(C_{1-6})烷基硫基、芳基硫基、 C_{1-6} 烷基磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷基磺醯基、 C_{1-6} 烷基亞磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷基亞磺醯基、芳基磺醯基、 C_{1-10} 烷基羰基、羥基羰基、 C_{1-10} 烷氧基羰基、胺基羰基、 C_{1-6} 烷基胺基羰基、二(C_{1-6} 烷基)-胺基羰基、N-(C_{1-3} 烷基)-N-(C_{1-3} 烷氧基)胺基羰基、 C_{1-6} 烷基羰基氧基、芳基羰基氧基、(C_{1-6})烷基胺基-羰基氧基、二(C_{1-6})烷基胺基-羰基氧基、芳基（其本身係視需要的地被 C_{1-6} 烷基或鹵素取代）、雜芳基（其本身係視需要的地被 C_{1-6} 烷基或鹵素取代）、雜環基（其本身係視需要的地被 C_{1-6} 烷基或鹵素取代）、芳基氧基（其中其中芳基基團係視需要的地被 C_{1-6} 烷基或鹵素取代）、雜芳基氧基（其中雜芳基基團係視需要的地被 C_{1-6} 烷基或鹵素取代）、雜環基氧基（其中雜環基基團係視需要的地被 C_{1-6} 烷基或鹵素取代）、胺基、 C_{1-6} 烷基胺基、二(C_{1-6})烷基胺基、 C_{1-6} 烷基羰基胺基、N-(C_{1-6})烷基羰基-N-(C_{1-6})烷基胺基、芳基羰基、（其中芳基基團本身係視需要的地被鹵素或 C_{1-6} 烷基取代）或者位在芳基或雜芳基系統上的兩毗鄰位置可環化以形成一個 5、6 或是 7 員碳環或雜環，該環本身係視需要的地被鹵素或 C_{1-6} 烷基取代。就芳基或雜芳基而言的其他取代基係包括芳基羰基胺基（其中芳基基團係被 C_{1-6} 烷基或是鹵素取代）、(C_{1-6})烷基氧基羰基胺基(C_{1-6})烷基氧基羰基-N-(C_{1-6})烷基胺基、芳基氧基羰基胺基（其中芳基基團係被 C_{1-6} 烷基或是鹵素取代）、芳基氧基羰基-N-(C_{1-6})烷基

胺基（其中芳基基團係被 C_{1-6} 烷基或是鹵素取代）、芳基磺醯基胺基（其中芳基基團係被 C_{1-6} 烷基或是鹵素取代）、芳基磺醯基-N-(C_{1-6})烷基胺基（其中芳基基團被 C_{1-6} 烷基或是鹵素取代）、芳基-N-(C_{1-6})烷基胺基（其中芳基基團係被 C_{1-6} 烷基或是鹵素取代）、芳基胺基（其中芳基基團係被 C_{1-6} 烷基或是鹵素取代）、雜芳基胺基（其中雜芳基基團係被 C_{1-6} 烷基或是鹵素取代）、雜環基胺基（其中雜環基基團係被 C_{1-6} 烷基或是鹵素取代）、胺基羧基胺基、 C_{1-6} 烷基胺基羧基胺基、二(C_{1-6})烷基胺基羧基胺基、芳基胺基羧基胺基（其中芳基基團係被 C_{1-6} 烷基或是鹵素取代）、芳基-N-(C_{1-6})烷基胺基羧基胺基（其中芳基基團係被 C_{1-6} 烷基或是鹵素取代）、 C_{1-6} 烷基胺基羧基-N-(C_{1-6})烷基胺基、二(C_{1-6})烷基胺基羧基-N-(C_{1-6})烷基胺基、芳基胺基羧基-N-(C_{1-6})烷基胺基（其中芳基基團係被 C_{1-6} 烷基或是鹵素取代）以及芳基-N-(C_{1-6})烷基胺基羧基-N-(C_{1-6})烷基胺基（其中芳基基團係被 C_{1-6} 烷基或是鹵素取代）。

雜環與雜環基等用詞指的是含有至多 10 個原子的非芳族單環或雙環系統，其包括一或多個（較佳為一或二個）選自於 O、S 與 N 的雜原子。該類環的例子包括 1,3-二氧噁戊環、氧雜環丁烷、四氫呋喃、嗎啉、硫代嗎啉及哌啶。

若出現時，位在雜環基上的視需要的取代基係包括 C_{1-6} 烷基與 C_{1-6} 鹵烷基以及該等上文提及烷基部分時所給定的視需要的取代基。

環烷基係包括環丙基、環丁基、環戊基和環己基。

環烯基係包括環戊烯基和環己烯基。

若出現時，位在環烷基或環烯基上的視需要的取代基係包括 C_{1-3} 烷基以及該等上文提及烷基部分時所給定的視需要的取代基。

碳環包括了芳基、環烷基及環烯基基團。

就經取代的苯基部分、雜環基及雜芳基基團而言，較佳的是一或多個取代基係分別選自於鹵素、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{1-6} 烷基硫基、 C_{1-6} 鹵烷基硫基、 C_{1-6} 烷基亞磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷基亞磺醯基、 C_{1-6} 烷基磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷基磺醯基、 C_{2-6} 烯基、 C_{2-6} 鹵烯基、 C_{2-6} 炔基、 C_{3-7} 環烷基、硝基、氰基、羥基羰基、 C_{1-6} 烷基羰基、 C_{1-6} 烷氧基羰基、芳基、雜芳基、 C_{1-6} 烷基胺基，二(C_{1-6} 烷基)胺基， C_{1-6} 烷基胺基羰基或二(C_{1-6} 烷基)胺基羰基。

欲被理解的是二烷基胺基取代基係包括該等其中二烷基基團和其所連接的 N 原子共同形成一個五、六或七員雜環，該雜環可含有一或二個選自於 O、N 或 S 的其他雜原子並可視需要的地被一或二個分別選定的(C_{1-6})烷基基團所取代。當雜環係藉由使 N 原子上的兩基團聯接而形成時，則所生成的環係適宜為吡咯啉、哌啉、N-甲基哌啶、硫代嗎啉及嗎啉，其各別可被一或二個分別選定的(C_{1-6})烷基基團取代。

較佳地，位在烷基部分上的視需要的取代基係包括下列當中的一或多者：鹵素、硝基、氰基、羥基羰基、 C_{1-10}

烷氧基（其本身係視需要的地被 C_{1-10} 烷氧基取代）、芳基（ C_{1-4} ）烷氧基、 C_{1-10} 烷基硫基、 C_{1-10} 烷基羰基、 C_{3-5} 環烷基羰基、 C_{1-10} 烷氧基羰基、 C_{1-6} 烷基胺基羰基、二（ C_{1-6} 烷基）胺基羰基、（ C_{1-6} ）烷基羰基氧基、經視需要的地取代之苯基、雜芳基、芳基氧基、芳基羰基氧基、雜芳基氧基、雜環基、雜環基氧基、 C_{3-7} 環烷基（其本身係視需要的地被（ C_{1-6} ）烷基或鹵素取代）、 C_{3-7} 環烷基氧基、 C_{5-7} 環烯基、 C_{1-6} 烷基磺醯基、 C_{1-6} 烷基亞磺醯基、三（ C_{1-4} ）烷基甲矽烷基、三（ C_{1-4} ）烷基甲矽烷基（ C_{1-6} ）烷氧基、芳基二（ C_{1-4} ）烷基甲矽烷基、（ C_{1-4} ）烷基二芳基甲矽烷基以及三芳基甲矽烷基。

較佳地，位在烯基或炔基上的視需要的取代基係包括鹵素、芳基和 C_{3-7} 環烷基當中的一或多者。

就雜環基而言，特佳的視需要的取代基為 C_{1-3} 烷基。

較佳地，環烷基的視需要的取代基係包括鹵素、氰基和 C_{1-6} 烷基。

環烯基的視需要的取代基係較佳包括 C_{1-3} 烷基、鹵素和氰基。

本發明特佳具體實例中， R^1 ， R^2 ， R^3 和 Z 的較佳基團以其任何組合係列於下方。

在較佳具體實例中，其中 R^1 係為 C_{1-5} 烷基。更佳者， R^1 係為 C_{2-4} 烷基。又更佳者， R^1 為乙基；正-丙基或異丙基。最佳者， R^1 為乙基或正丙基。

在特定具體實例中， R^2 為係為 C_{1-5} 烷基， C_{1-5} 鹵烷基， C_{2-5} 烯基， C_{2-5} 鹵烯基， C_{2-5} 炔基， C_{3-6} 環烷基， C_{1-5} 烷氧

基， C_{1-5} 鹵烷基， C_{1-3} 烷氧基(C_{1-3})烷基， C_{1-5} 烷基硫基， C_{1-5} 鹵烷基硫基，氰基，硝基或甲醯基。

此外，在較佳具體實例中， R^2 為係為 C_{1-2} 烷基，環丙基， C_{1-2} 鹵烷基， C_{2-3} 烯基， C_{2-3} 鹵烯基或 $-CH=NR^{18}$ 基團，其中 R^{18} 係為羥基或甲氧基。更佳者， R^2 為甲基。

在一較佳具體實例中， R^3 為係為 C_{1-2} 鹵烷基。更佳者， R^3 為氟甲基，二氟甲基或三氟甲基。最佳者， R^3 為三氟甲基。

在式(I)化合物的較佳具體基團中，Z 為氫；氰基；甲醯基；視需要經取代的 C_{1-6} 烷基； C_{3-6} 烯基； C_{3-6} 鹵烯基； C_{3-6} 炔基； C_{1-6} 烷基硫基； C_{1-6} 鹵烷基硫基； C_{1-6} 氰基烷基硫基；視需要經取代的苯基硫基，其中該取代基係選自鹵素，硝基，氰基， C_{1-3} 烷基和 C_{1-3} 烷氧基； C_{1-6} 烷基二硫基；二(C_{1-4} 烷基)胺基硫基；視需要經取代的 C_{1-6} 烷基羰基，其中該取代基係選自鹵素，氰基和 C_{1-3} 烷氧基； C_{2-6} 烯基羰基； C_{3-6} 環烷基羰基；視需要經取代的苯基羰基，鹵素，硝基，氰基， C_{1-3} 烷基和 C_{1-3} 烷氧基；視需要經取代的雜芳基羰基，其中該取代基係選自鹵素，硝基，氰基， C_{1-3} 烷基和 C_{1-3} 烷氧基； C_{1-6} 烷氧基羰基； C_{1-6} 烷基硫基羰基；視需要經取代的苯基硫基羰基，其中該取代基係選自鹵素，硝基，氰基， C_{1-3} 烷基和 C_{1-3} 烷氧基；N,N-二 C_{1-3} 烷基胺基羰基； C_{1-3} 烷基胺基羰基； C_{3-5} 烯基胺基羰基； C_{3-5} 炔基胺基羰基；苯基胺基羰基，其中苯基視需要經鹵素，硝基，氰基， C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 烷氧基取代；N-苯基-N-甲基胺基羰基，其中苯

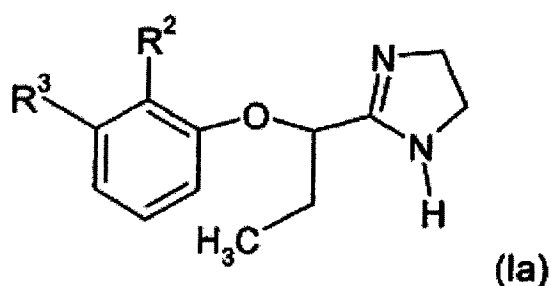
基視需要經鹵素，硝基，氰基， C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 烷氧基取代； C_{1-6} 烷氧基硫基羰基； C_{1-6} 烷基硫基硫羰基羰基；視需要經取代的苯基硫基硫羰基羰基，其中該取代基係選自鹵素，硝基，氰基， C_{1-3} 烷基和 C_{1-3} 烷氧基；N,N-二 C_{1-3} 烷基胺基硫羰基羰基；苯基胺基硫羰基羰基，其中苯基視需要經鹵素，硝基，氰基， C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 烷氧基取代；N-苯基-N-甲基胺基硫羰基羰基，其中苯基視需要經鹵素，硝基，氰基， C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 烷氧基取代； C_{1-3} 烷基磺醯基； C_{1-3} 鹵烷基磺醯基； C_{1-3} 烯基磺醯基；視需要經取代的苯基磺醯基，其中該取代基係選自鹵素，硝基，氰基， C_{1-3} 烷基和 C_{1-3} 烷氧基；N,N-二 C_{1-3} 烷基胺基磺醯基；二 C_{1-3} 烷氧基-P(=O)-；二 C_{1-3} 烷基硫基-P(=O)-；二 C_{1-3} 烷氧基-P(=S)-，二 C_{1-3} 烷基硫基-P(=S)-，(C_{1-3} 烷氧基)-(苯基)P(=O)-，(C_{1-3} 烷氧基)(苯基)(P=S)-， C_{1-3} 烷基-N=CH-， C_{1-3} 烷氧基-N=CH-，氰基-N=CH-，苯基-N=CH-(其中苯基視需要經鹵素，硝基，氰基，或 C_{1-3} 烷氧基取代)，2-吡啶基-N=CH-，3-吡啶基-N=CH-，2-噻唑基-N=CH-，或之前所述式(II)化合物(其中 B 係為 S-或 CH-)，以及其中 Z 為視需要經取代 C_{1-6} 烷基，其中該取代基係選自 1 至 7 個氟原子；1 至 3 個氯原子；1 至 3 個溴原子；氰基；1 至 2 個 C_{1-3} 烷氧基； C_{1-3} 鹵烷氧基； C_{1-3} 烷基硫基； C_{1-3} 鹵烷基硫基；烯丙基氧基；丙炔基氧基； C_{3-6} 環烷基；苯基，其中該苯基係視需要經鹵素；硝基，氰基， C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 烷氧基取代； C_{1-3} 烷基羰基氧基； C_{1-3} 烷氧基羰基； C_{1-3} 烷基羰基；視需要經取代的苯甲

鹽基，該取代基係選自鹵素，硝基， C_{1-3} 烷基， C_{1-3} 烷氧基以及氰基。

更佳者，Z 為氫，氰基，甲鹽基， C_{1-3} 烷基， C_{1-3} 鹵烷基， C_{1-3} 氰基烷基， C_{1-3} 烷氧基- C_{1-3} 烷基， C_{1-3} 苯甲鹽基氧基- C_{1-3} 烷基，烯丙基，丙烯基，炔丙基， C_{1-3} 烷基硫基， C_{1-3} 鹵烷基硫基，苯基硫基(視需要經鹵素， C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 烷氧基取代)， C_{1-6} 烷基羰基，苯基羰基(視需要經鹵素， C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 烷氧基取代)， C_{1-6} 烷氧基羰基， C_{1-3} 烷基胺基羰基，苯基胺基羰基(其中苯基視需要經鹵素， C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 烷氧基取代)， C_{1-3} 烷基胺基硫羰基羰基，苯基胺基硫羰基羰基(其中苯基視需要經鹵素， C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 烷氧基取代)， C_{1-3} 烷基磺鹽基， C_{1-3} 鹵烷基磺鹽基，二(C_{1-3} 烷氧基)-P(=O)-， C_{1-3} 烷氧-N=CH-，氰基-N=CH-，以及 2-吡啶基-N=CH-。

最佳者，Z 係為氫。

以下所述化合物係例示本發明新穎的化合物。表 1 提供 56 個式 Ia 化合物



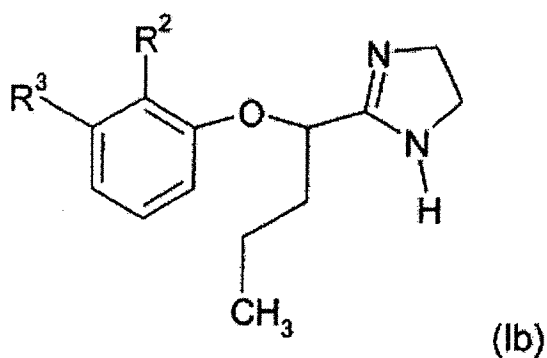
其中和 R^3 值如下表所示。

表 1

化 合 物 編 號	R^3	R^2
I-1	CF_3	-CN
I-2	CF_3	-NO ₂
I-3	CF_3	甲 基
I-4	CF_3	乙 基
I-5	CF_3	丙 基
I-6	CF_3	異 丙 基
I-7	CF_3	$Cl_2C=CH-$
I-8	CF_3	乙 烯 基
I-9	CF_3	烯 丙 基
I-10	CF_3	丙 炔 基
I-11	CF_3	CF_3
I-12	CF_3	CHF_2
I-13	CF_3	CH_2F
I-14	CF_3	CH_2Cl
I-15	CF_3	CCl_3
I-16	CF_3	環 丙 基
I-17	CF_3	MeO
I-18	CF_3	F_3CO
I-19	CF_3	F_2HCO
I-20	CF_3	$MeOCH_2$
I-21	CF_3	MeS
I-22	CF_3	F_3CS
I-23	CF_3	F_2HCS
I-24	CHF_2	-CN
I-25	CHF_2	-NO ₂
I-26	CHF_2	甲 基
I-27	CHF_2	乙 基
I-28	CHF_2	乙 烯 基
I-29	CHF_2	CF_3
I-30	CHF_2	CH_2F
I-31	CHF_2	CH_2Cl
I-32	CHF_2	CF_2Cl
I-33	CHF_2	CCl_3
I-34	CHF_2	環 丙 基
I-35	CH_2F	-CN
I-36	CH_2F	-NO ₂
I-37	CH_2F	甲 基
I-38	CH_2F	乙 基

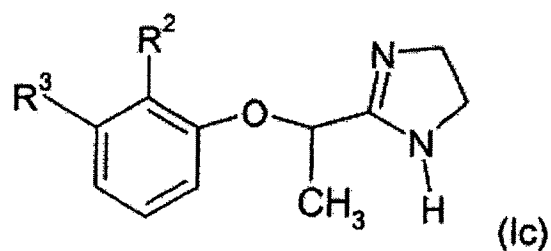
I-39	CH ₂ F	乙 烯 基
I-40	CH ₂ F	CF ₃
I-41	CH ₂ F	CH ₂ F
I-42	CH ₂ F	CH ₂ Cl
I-43	CH ₂ F	CF ₂ Cl
I-44	CH ₂ F	CCl ₃
I-45	CH ₂ F	環 丙 基
I-46	CF ₂ Cl	-CN
I-47	CF ₂ Cl	-NO ₂
I-48	CF ₂ Cl	甲 基
I-49	CF ₂ Cl	乙 基
I-50	CF ₂ Cl	乙 烯 基
I-51	CF ₂ Cl	CF ₃
I-52	CF ₂ Cl	CH ₂ F
I-53	CF ₂ Cl	CH ₂ Cl
I-54	CF ₂ Cl	CF ₂ Cl
I-55	CF ₂ Cl	CCl ₃
I-56	CF ₂ Cl	環 丙 基

56 個 式 (Ib) 化 合 物 :



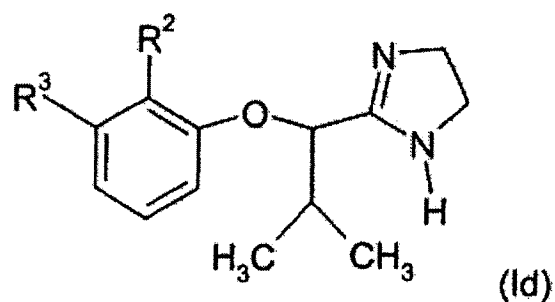
其中 R² 和 R₃ 值係如表 1 化合物 I-1 至 I-56 所示，其分別被命名為化合物 II-1 至 II-56。

56 個 式 (Ic) 化 合 物 :



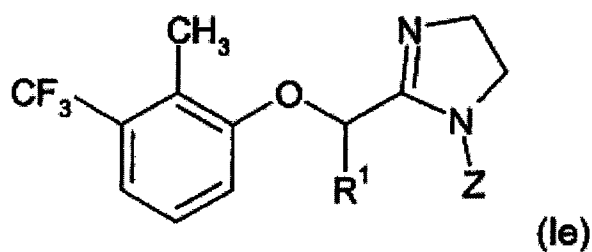
其中 R^2 和 R^3 值係如表 1 化合物 I-1 至 I-56 所示，其分別被命名為化合物編號第 III-1 至 III-56。

56 個式 (Id) 化合物：



其中 R^2 和 R^3 值係如表 1 化合物 I-1 至 I-56 所示，其分別被命名為化合物編號第 VIII-1 至 VIII-56。

表 2 提供 194 個式 Ie 化合物



其中 R^1 和 Z 值係如以下表 2 所示。

表 2

化合物編號	R^1	Z
V-1	乙基	-CN-
V-2	乙基	NO ₂
V-3	乙基	甲基
V-4	乙基	乙基
V-5	乙基	丙基

V-6	乙基	丁基
V-7	乙基	烯丙基
V-8	乙基	异丙烯基
V-9	乙基	乙烯基
V-10	乙基	丁-2-烯-1-基
V-11	乙基	丙炔基
V-12	乙基	丁-1-烯-1-基
V-13	乙基	丁-3-烯-1-基
V-14	乙基	丁-1-烯-2-基
V-15	乙基	丁-2-烯-2-基
V-16	乙基	丁-3-烯-2-基
V-17	乙基	甲氧基甲基
V-18	乙基	乙氧基甲基
V-19	乙基	丙氧基甲基
V-20	乙基	苄氧基甲基
V-21	乙基	1-甲氧基乙基
V-22	乙基	2-甲氧基乙基
V-23	乙基	-CH ₂ OCOMe
V-24	乙基	-CH ₂ OCOEt
V-25	乙基	-CH ₂ OCOiPr
V-26	乙基	-CH ₂ OCOtBu
V-27	乙基	-CH ₂ OCOPh
V-28	乙基	-CH ₂ OCOOEt
V-29	乙基	-CH=N-OMe
V-30	乙基	-CH=N-OEt
V-31	乙基	-CH=N-Me
V-32	乙基	-CH=N-Et
V-33	乙基	-CH=N-Ph
V-34	乙基	-CH=N-(2-吡啶基)
V-35	乙基	-CH=N-C≡N
V-36	乙基	-P(O)(OEt) ₂
V-37	乙基	-P(S)(OEt) ₂
V-38	乙基	-P(O)(OMe) ₂
V-39	乙基	-P(S)(OMe) ₂
V-40	乙基	-P(O)(OPh) ₂
V-41	乙基	-P(S)(OPh) ₂
V-42	乙基	-P(O)(OBn) ₂
V-43	乙基	-P(S)(OBn) ₂

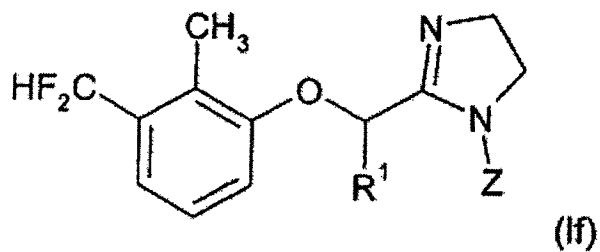
V-44	乙基	-P(O)(NMe) ₂
V-45	乙基	-P(S)(NMe ₂) ₂
V-46	乙基	-P(O)(NEt ₂) ₂
V-47	乙基	-P(S)(NEt ₂) ₂
V-48	乙基	-OH
V-49	乙基	-OMe
V-50	乙基	-OAc
V-51	乙基	-OBz
V-52	乙基	SMe
V-53	乙基	SCCl ₃
V-54	乙基	SPh
V-55	乙基	S(O)Ph
V-56	乙基	S(O) ₂ Me
V-57	乙基	S(O) ₂ CF ₃
V-58	乙基	S(O) ₂ Ph
V-59	乙基	C(O)Me
V-60	乙基	C(O)Et
V-61	乙基	C(O)iPr
V-62	乙基	C(O)tBu
V-63	乙基	C(O)CH ₂ OMe
V-64	乙基	C(O)CH ₂ Cl
V-65	乙基	C(O)CHCl ₂
V-66	乙基	C(O)CCl ₃
V-67	乙基	C(O)Ph
V-68	乙基	C(O)(4-氟苯基)
V-69	乙基	C(O)(4-氯苯基)
V-70	乙基	C(O)(4-甲氧基苯基)
V-71	乙基	C(O)(2,4-二氯苯基)
V-72	乙基	C(O)(2,6-二氯苯基)
V-73	乙基	C(O)(2,6-二氟苯基)
V-74	乙基	C(O)OMe
V-75	乙基	C(O)OEt
V-76	乙基	C(O)iPr
V-77	乙基	C(O)tBu
V-78	乙基	C(O)OPh
V-79	乙基	C(O)O(4-氟苯基)
V-80	乙基	C(O)O(4-氯苯基)
V-81	乙基	C(O)O(4-甲氧基苯基)

V-82	乙基	C(O)O(2,4-二氯苯基)
V-83	乙基	C(O)O(2,6-二氯苯基)
V-84	乙基	C(O)O(2,6-二氟苯基)
V-85	乙基	C(O)NHMe
V-86	乙基	C(O)NMe ₂
V-87	乙基	C(O)NHEt
V-88	乙基	C(O)Net ₂
V-89	乙基	C(O)NHiPr
V-90	乙基	C(O)NHtBu
V-91	乙基	C(O)NHPh
V-92	乙基	C(O)NH(4-氟苯基)
V-93	乙基	C(O)NH(4-氯苯基)
V-94	乙基	C(O)NH(4-甲氧基苯基)
V-95	乙基	C(O)NH(2,4-二氯苯基)
V-96	乙基	C(O)NH(2,6-二氯苯基)
V-97	乙基	C(O)NH(2,6-二氟苯基)
V-98	正丙基	-CN-
V-99	正丙基	NO ₂
V-100	正丙基	甲基
V-101	正丙基	乙基
V-102	正丙基	丙基
V-103	正丙基	丁基
V-104	正丙基	烯丙基
V-105	正丙基	异丙烯基
V-106	正丙基	乙烯基
V-107	正丙基	丙炔基
V-108	正丙基	丁-2-烯-1-基
V-109	正丙基	丁-1-烯-1-基
V-110	正丙基	丁-3-烯-1-基
V-111	正丙基	丁-1-烯-2-基
V-112	正丙基	丁-2-烯-2-基
V-113	正丙基	丁-3-烯-2-基
V-114	正丙基	甲氧基甲基
V-115	正丙基	乙氧基甲基
V-116	正丙基	丙氧基甲基
V-117	正丙基	苄氧基甲基
V-118	正丙基	1-甲氧基乙基
V-119	正丙基	2-甲氧基乙基

V-120	正丙基	-CH ₂ OCOMe
V-121	正丙基	-CH ₂ OCOEt
V-122	正丙基	-CH ₂ OCO _i Pr
V-123	正丙基	-CH ₂ OCOtBu
V-124	正丙基	-CH ₂ OCOPh
V-125	正丙基	-CH ₂ OCOOEt
V-126	正丙基	-CH=N-OMe
V-127	正丙基	-CH=N-OEt
V-128	正丙基	-CH=N-Me
V-129	正丙基	-CH=N-Et
V-130	正丙基	-CH=N-Ph
V-131	正丙基	-CH=N-(2-吡啶基)
V-132	正丙基	-CH=N-C≡N
V-133	正丙基	-P(O)(OEt) ₂
V-134	正丙基	-P(S)(OEt) ₂
V-135	正丙基	-P(O)(OMe) ₂
V-136	正丙基	-P(S)(OMe) ₂
V-137	正丙基	-P(O)(OPh) ₂
V-138	正丙基	-P(S)(OPh) ₂
V-139	正丙基	-P(O)(OBn) ₂
V-140	正丙基	-P(S)(OBn) ₂
V-141	正丙基	-P(O)(NMe) ₂
V-142	正丙基	-P(S)(NMe) ₂
V-143	正丙基	-P(O)(NEt) ₂
V-144	正丙基	-P(S)(NEt) ₂
V-145	正丙基	-OH
V-146	正丙基	-OMe
V-147	正丙基	-OAc
V-148	正丙基	-OBz
V-149	正丙基	SMe
V-150	正丙基	SCCl ₃
V-151	正丙基	SPh
V-152	正丙基	S(O)Ph
V-153	正丙基	S(O) ₂ Me
V-154	正丙基	S(O) ₂ CF ₃
V-155	正丙基	S(O) ₂ Ph
V-156	正丙基	C(O)Me
V-157	正丙基	C(O)Et

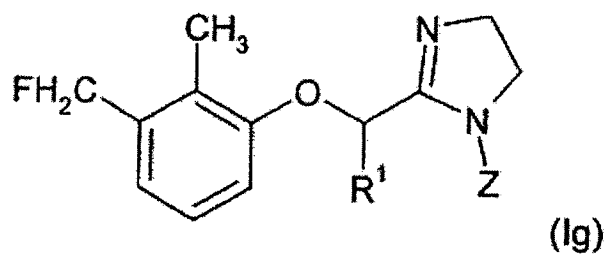
V-158	正丙基	C(O)iPr
V-159	正丙基	C(O)tBu
V-160	正丙基	C(O)CH ₂ OMe
V-161	正丙基	C(O)CH ₂ Cl
V-162	正丙基	C(O)CHCl ₂
V-163	正丙基	C(O)CCl ₃
V-164	正丙基	C(O)Ph
V-165	正丙基	C(O)(4-氟苯基)
V-166	正丙基	C(O)(4-氯苯基)
V-167	正丙基	C(O)(4-甲氧基苯基)
V-168	正丙基	C(O)(2,4-二氯苯基)
V-169	正丙基	C(O)(2,6-二氯苯基)
V-170	正丙基	C(O)(2,6-二氯苯基)
V-171	正丙基	C(O)OMe
V-172	正丙基	C(O)OEt
V-173	正丙基	C(O)iPr
V-174	正丙基	C(O)tBu
V-175	正丙基	C(O)OPh
V-176	正丙基	C(O)O(4-氟苯基)
V-177	正丙基	C(O)O(4-氯苯基)
V-178	正丙基	C(O)O(4-甲氧基苯基)
V-79	正丙基	C(O)O(2,4-二氯苯基)
V-180	正丙基	C(O)O(2,6-二氯苯基)
V-181	正丙基	C(O)O(2,6-二氯苯基)
V-182	正丙基	C(O)NHMe
V-183	正丙基	C(O)NMe ₂
V-184	正丙基	C(O)NH ₂ tBu
V-185	正丙基	C(O)NMe ₂
V-186	正丙基	C(O)NH ₂ iPr
V-187	正丙基	C(O)NH ₂ tBu
V-188	正丙基	C(O)NHPh
V-189	正丙基	C(O)NH(4-氟苯基)
V-190	正丙基	C(O)NH(4-氯苯基)
V-191	正丙基	C(O)NH(4-甲氧基苯基)
V-192	正丙基	C(O)NH(2,4-二氯苯基)
V-193	正丙基	C(O)NH(2,6-二氯苯基)
V-194	正丙基	C(O)NH(2,6-二氯苯基)

194 個式 (If) 化合物



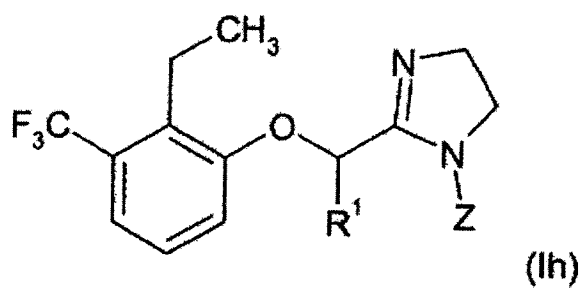
其中 R^1 和 Z 值係如表 2 化合物 V-1 至 V-194 所示，其分別被命名為化合物編號第 VI-1 至 VI-194。

194 個式 (Ig) 化合物



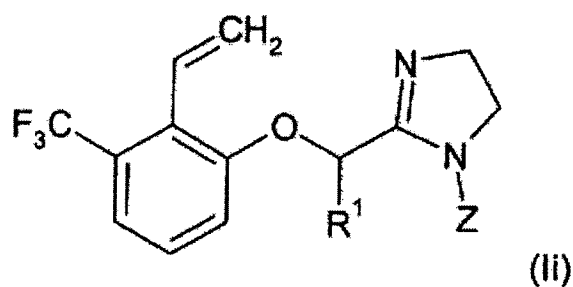
其中 R^1 和 Z 值係如表 2 化合物 V-1 至 V-194 所示，其分別被命名為化合物編號第 VII-1 至 VII-194。

194 個式 (Ih) 化合物



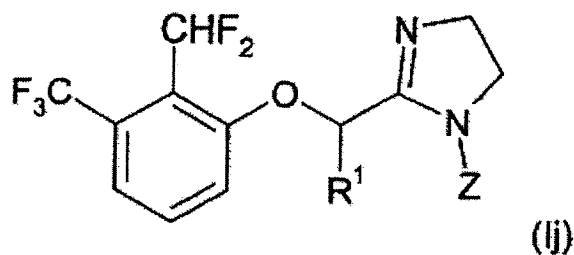
其中 R^1 和 Z 值係如表 2 化合物 V-1 至 V-194 所示，其分別被命名為化合物編號第 XVII-1 至 VIII-194。

194 個式 (Ii) 化合物



其中 R^1 和 Z 值係如表 2 化合物 V-1 至 V-194 所示，其分別被命名為化合物編號第 IX-1 至 IX-194。

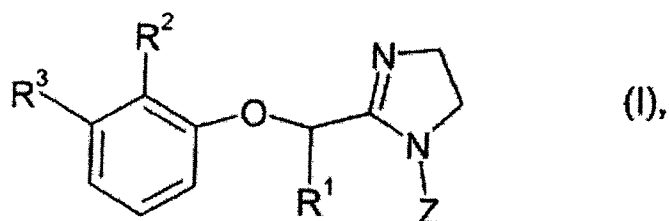
194 個式 (Ij) 化合物



其中 R^1 和 Z 值係如表 2 化合物 V-1 至 V-194 所示，其分別被命名為化合物編號第 X-1 至 X-194。

以下表 3 提供本發明上述一些化合物的特徵數據；其他化合物僅於下述特徵數據敘述。

表 3 本發明化合物的特徵數據



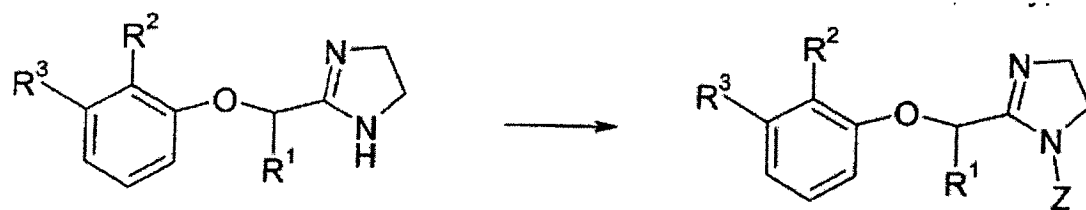
化 合 物 編 號	R ¹	R ²	R ³	Z	鹽	熔 點 °C
1.001	乙 基	甲 基	CF ₃	H		125-126
1.002	乙 基	CHF ₂	CF ₃	H		88-91
1.003	正 丙 基	甲 基	CF ₃	H		106-108
1.004	正 丁 基	甲 基	CF ₃	H		95-97
1.005	異 丙 基	甲 基	CF ₃	H		85-89
1.006	乙 基	C≡CH	CF ₃	H		92-96
1.007	乙 基	CH=NOH	CF ₃	H		膠
1.008	乙 基	CH=CH ₂	CF ₃	H		100-105
1.009	乙 基	CH ₂ OH	CF ₃	H	氯化鹽	150-157
1.010	乙 基	CH ₂ OMe	CF ₃	H		128-155
1.011	乙 基	乙 基	CF ₃	H	草酸鹽	185-187
1.012	正 丙 基	SMe	CF ₃	H	順 丁 烯 二 酸 鹽	90-109
1.013	乙 基	CF ₃	CF ₃	H		127-133
1.014	正 丙 基	S(O)Me	CF ₃	H		134-140
1.015	正 丙 基	S(O) ₂ Me	CF ₃	H		112-120
1.016	正 丙 基	甲 基	CHF ₂	H		127-128
1.017	乙 基	cPr	CHF ₂	H		94-100
1.018	乙 基	CH=NOMe	CF ₃	H		89-99
1.019	正 丁 基	甲 基	CHF ₂	H		92-93
1.020	正 丁 基	甲 基	CH ₂ F	H		87-8
1.021	異 丙 基	甲 基	CHF ₂	H		82-84
1.022	乙 基	甲 基	CH ₂ F	H		77-78
1.023	乙 基	甲 基	CHF ₂	H		111-114
1.024		甲 基	CH ₂ F	H		84-85
1.025	乙 基	CH=CHMe	CF ₃	H		64-67
1.026	乙 基	CH=CHBr	CF ₃	H		91-124
1.027	乙 基	CH=CHOMe	CF ₃	H	順 丁 烯 二 酸 鹽	98-110
1.028	正 丙 基	甲 基	CF ₃	H	氯化鹽	173-175

- a) E 或 Z 形式
- b) 單一非對映異構物對
- c) E 和 Z 形式

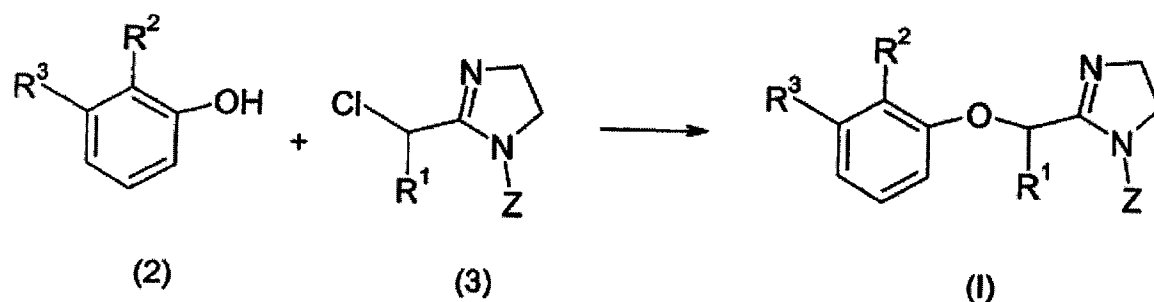
【實施方式】

本發明化合物可藉由多種方法加以製備，例如以下所列者。

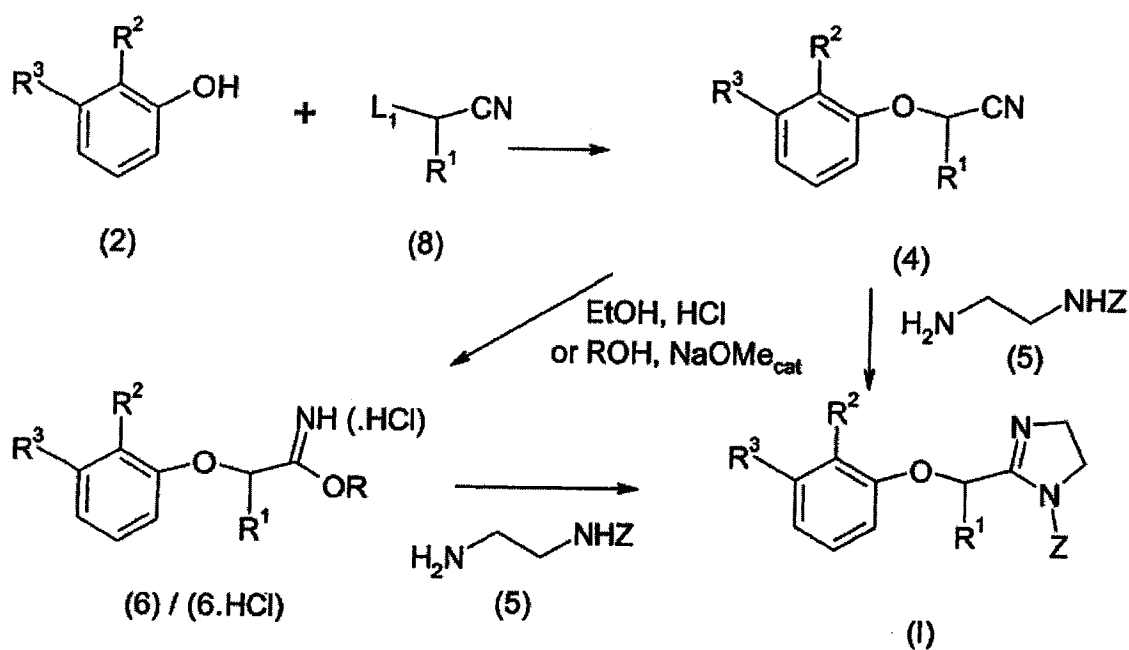
式(I)化合物其中 Z 不為 H 者可用適當的試劑處理式(I)化合物其中 Z 為 H 者而加以製備。視 Z 的性質而定，試劑可為例如烷基化劑，鹽化劑，胺基甲鹽化劑，磷鹽化劑，亞磺鹽化劑或氧化劑。此等衍生化劑一般係為親電性。將 NH 基團轉化成為 NZ 基團的方法可在例如 T.W. Greene and P.G.M. Wuts “Protecting Groups in Organic Synthesis” 第三版，Wiley, N.Y. 1999 中發現。



式(I)化合物可藉由式 2 酚與式 3 之 2-鹵烷基咪唑啉的烷基化(J. Am. Chem. Soc. 1947, 69,1688)加以製備。

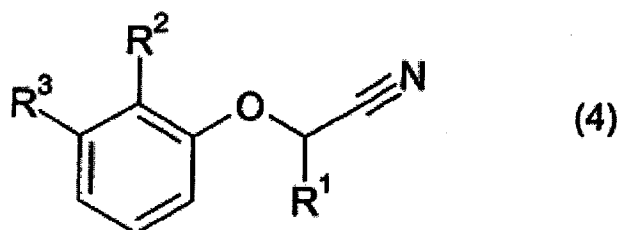


式(I)化合物可藉由以式(5)的二胺(其中 Z 具有如上所述的意義)處理式(4)的腈而加以製備。此製備有利地在觸媒如 CS_2 , P_2S_5 (J. Med. Chem., 2003 46, 1962) 或 Na_2S_4 (DE 2512513) 存在下進行。可使用醇類例如甲醇和觸媒數量的鹼如 NaOH 將腈(4)轉換成為式(6)的亞胺酯, 或者使用醇類例如甲醇或乙醇和酸例如鹽酸將腈(4)轉換成為式(6)的亞胺鹽。式(6)的亞胺酯經式(5)的二胺處理可被轉換成為式(I)化合物 (J. Am. Chem. 2004, 47, 6160; J. Am. Chem. Soc. 1947, 69, 1688)。式(4)的腈可藉由使用含有離去基團 L_1 式(8)的腈使式(2)的酚烷基化而加以製備 (J. Am. Chem. Soc. 1947, 69, 1688)。



式 4 化合物，其中 R^1 為 C_{1-10} 烷基； R^2 為 C_{1-5} 烷基， C_{1-5} 鹵烷基， C_{2-5} 烯基， C_{2-5} 鹵烯基， C_{2-5} 炔基， C_{3-6} 環烷基， C_{1-5} 烷氧基， C_{1-5} 鹵烷氧基， C_{1-3} 烷氧基(C_{1-3})烷基， C_{1-5} 烷基硫基， C_{1-5} 鹵烷基硫基，氰基，硝基或甲醯基；以及 R^3 為 C_{1-5} 鹵烷基；羥基- C_{1-6} 烷基，或甲醯基，已被特定設計為合成式 I 化合物的中間物且因此形成本發明另一內容。

表 4 本發明化合物的特徵數據

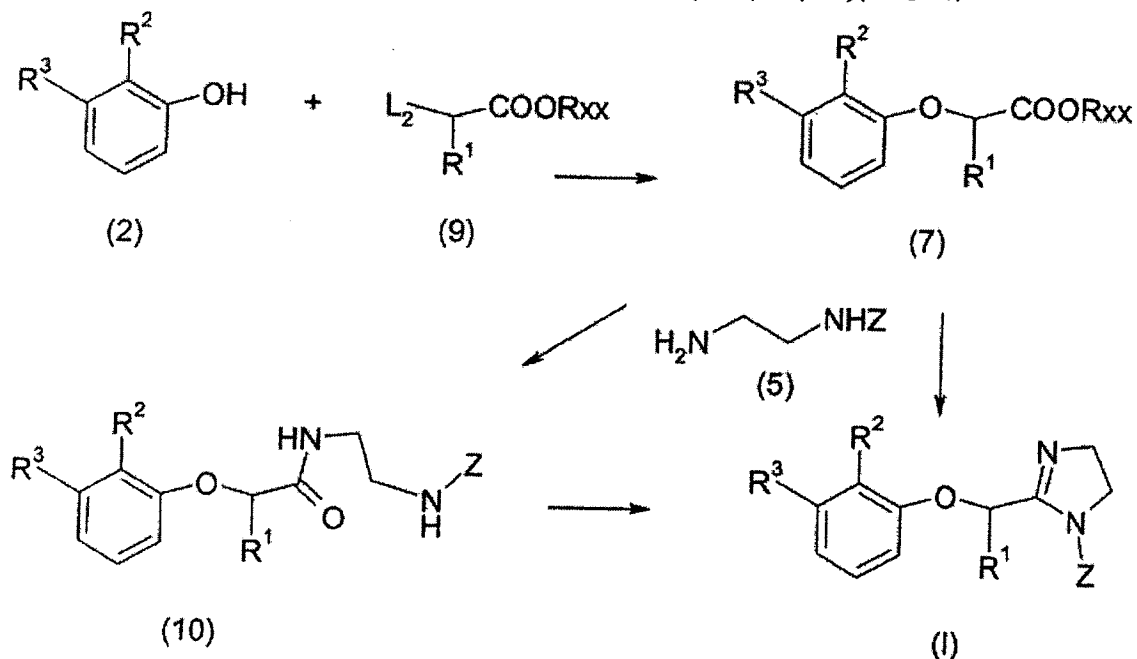


化合物編號	R1	R2	R3	物理數據
4.001	CH ₂ CH ₃	Me	CF ₃	油

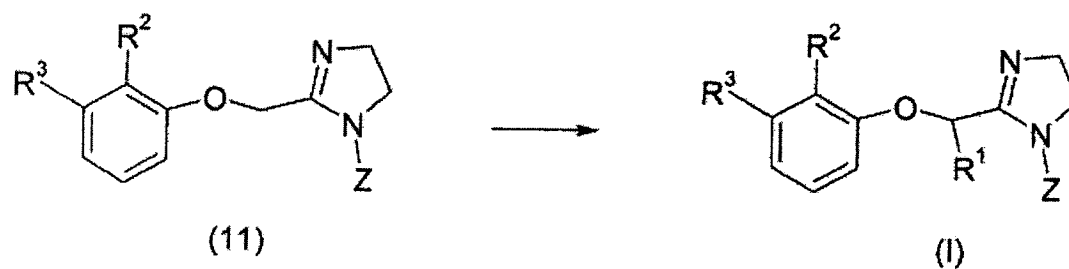
(7)的酯可藉由使用式(5)的二胺的處理而被轉換成為式(I)的咪唑啉(J.Am.Chem. Soc.1950, 72, 4443-5)。可使用有利於此反應的烷基鋁劑。此轉換涉及二步驟，其係首先藉由形成單醯胺(10)，其可作為至式(1)的咪唑啉前驅物。式(7)的酯可製備於以式(9)的酯(其中 L_2 為離去基且 R_{xx} 為視需要經取代的烷基或芳基(典型為 C_1-C_6 烷基，苯基或苄基))使式(2)的酚烷基化而加以製備。

離去基 L_1 和 L_2 典型為用於 S_N2 反應者。 L_1 和 L_2 在離開其基材(8)和(9)時變成有機或無機酸的陰離子。典型的

離子基包括例如，鹵化物如氯化物或溴化物。烷基磺酸酯例如甲磺酸酯和芳基磺酸酯例如對-甲苯磺酸酯。



式(1)化合物可藉由導入基團 R^1 而自式(11)的咪唑啉加以製備。此可藉由鹼處理(11)，然後接著以能夠導入基團 R^1 的親電子試劑加以處理。典型的親電子試劑可為鹵化物例如 $R^1\text{-Cl}$ ， $R^1\text{-Br}$ ，或 $R^1\text{-I}$ 。典型的鹼可為正丁基鋰或均三甲苯基-鋰。Z 基團可為保護基團例如 $t\text{BuOCO}$ 或 $(\text{CH}_3)_3\text{Si}$ 或，若有需要可予以除去，且若有需要可將不同的 Z 基團如上所述予以接附。



化合物(2)，(3)，(5)，(8)和(9)為習知化合物或者可使用為此技藝所習知的例行方法自習知化合物輕易地製備。

式(11)化合物其中 R^3 和 Z 係如以上所定義， R^2 為 C_{2-5} 烷基， C_{1-5} 鹵烷基， C_{2-5} 烯基， C_{2-5} 鹵烯基， C_{2-5} 炔基， C_{3-6} 環烷基， C_{1-5} 烷氧基， C_{1-5} 鹵烷氧基， C_{1-3} 烷氧基(C_{1-3})烷基， C_{1-5} 烷基硫基， C_{1-5} 鹵烷基硫基，氰基，硝基或甲醯基；以及 R^3 為 C_{1-5} 鹵烷基；羥基- C_{1-6} 烷基，係為新穎者。此等新穎中間物形成本發明另一內容。

本發明第二內容中，式(I)之化合物可用來抵抗及控制昆蟲有害生物例如鱗翅目(Lepidoptera)、雙翅目(Diptera)、半翅目(Hemiptera)、纓翅目(Thysanoptera)、直翅目(Orthoptera)、鞘翅目(Coleoptera)、蚤目(Siphonaptera)、膜翅目(Hymenoptera)和等翅目(Isoptera)的感染以及其他的無脊骨的有害生物，例如，蟎類，線蟲和軟體動物的有害生物。昆蟲，蟎類，線蟲和軟體動物在下文中總稱有害生物。

“對抗”及“控制”用語係意味著式(I)化合物可用於預防或抑制作物或作物所在地被有害生物感染。感染的程度可藉由任何適當的為此技藝人士所習知的方法加以測定。觀察到抑制感染，其中經式(I)化合物處理的作物/作物所在地的感染程度低於未經式(I)化合物處理的作物/作物所在地所觀察或預測的感染程度。

“控制”及“掌控”用語係意味著有害生物被驅逐，無法進食，無法繁殖及/或被殺死。因此，本發明方法係涉及使用足以驅除該有害生物的活性成份的數量(驅除有效量的活性成份)、足以阻止有害生物進食的活性成份的數量、足以抑制繁殖的活性成份的數量(例如抑制產卵或排卵，或藉由調

節殺卵效應)、或者其可涉及使用殺昆蟲、殺線蟲或殺螺有效數量的活性(亦即足以殺死該有害生物的數量),或者本發明方法可涉及任何上述效應的組合。

該等可藉由使用本發明化合物對抗和控制的有害生物包括該等與農業(該術語包括食物、燃料和纖維產物的農作物之生長)、園藝和動物農事、寵物、林產和蔬菜源(例如水果,穀粒和木材)的產物之儲存有關之有害生物;該等與人造結構的損害及人和動物的疾病傳播有關之有害生物;以及討厭的有害生物(例如蒼蠅)。

可被(I)之化合物控制的有害生物種類之實例包括:桃蚜(*Myzus persicae*)(蚜蟲)、棉蚜(*Aphis gossypii*)(蚜蟲)、豆蚜(*Aphis fabae*)(蚜蟲)、盲蝽屬(*Lygus* spp.)(盲蝽)、紅椿屬(*Dysdercus* spp.)(盲蝽)、褐飛蟲(*Nilaparvata lugens*)(飛虱(planthopper))、黑尾葉蟬(*Nephotettix inciticeps*)(葉蟬(leafhopper))、綠椿屬(*Nezara* spp.)(椿象(stinkbugs))、褐椿屬(*Euschistus* spp.)(椿象)、緣椿屬(*Leptocorisa* spp.)(椿象)、西方花薊馬(*Frankliniella occidentalis*)(薊馬)、薊馬屬(*Thrips* spp.)(薊馬)、馬鈴薯甲蟲(*Leptinotarsa decemlineata*)(科羅拉多馬鈴薯甲蟲(Colorado potato beetle))、棉象蟲(*Anthonomus grandis*)(棉鈴蟲(bollworm))、介殼蟲屬(*Aonidiella* spp.)(介殼蟲)、粉蟲屬(*Trialeurodes* spp.)(白粉蟲(white flies))、菸草粉蟲(*Bemisia tabaci*)(白粉蟲)、歐洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis*)(歐洲玉米螟)、海灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis*)(棉葉蟲(cotton

leafworm))、菸草青蟲(*Heliothis virescens*)(煙夜蛾(*tobacco budworm*))、玉米穗蟲(*Helicoverpa armigera*)(棉鈴蟲)、美洲棉鈴蟲(*Helicoverpa zea*)(棉鈴蟲)、棉捲葉螟(*Sylepta derogata*)(棉捲葉蟲)、大菜粉蝶(*Pieris brassicae*)(白粉蝶)、小菜蛾(*Plutella xylostella*)(吊絲蟲(*diamond back moth*))、地老虎屬(*Agrotis* spp.)(切根蟲)、二化螟蟲(*Chilo suppressalis*)(稻鑽心蟲)、飛蝗(*Locusta migratoria*)(蝗蟲)、澳洲蝗蟲(*Chortiocetes terminifera*)(蝗蟲)、條葉甲屬(*Diabrotica* spp.)(根蟲)、蘋果全爪踣(*Panonychus ulmi*)(歐洲紅蟎)、柑橘全爪踣(*Panonychus citri*)(柑桔葉蟎)、二點葉踣(*Tetranychus urticae*)(二點葉踣(*two-spotted spider mite*))、紅葉踣(*Tetranychus cinnabarinus*)(紅蜘蛛(*carmine spider mite*))、柑桔銹蟬(*Phyllocoptruta oleivora*)(柑桔鏽壁蟲(*citrus rust mite*))、側多食跗線蟎(*Polyphagotarsonemus latus*)(細蟎)、短鬚蟎屬(*Brevipalpus* spp.)(平蟎(*flat mites*))、牛壁蟲(*Boophilus microplus*)(牛蚤)、狗壁蟲(*Dermacentor variabilis*)(美洲狗蚤)、貓蚤(*Ctenocephalides felis*)(貓蚤)、斑潛蠅屬(*Liriomyza* spp.)(潛葉蟲(*leafminer*))、家蠅(*Musca domestica*)(家蠅)、埃及斑蚊(*Aedes aegypti*)(蚊蟲)、瘧蚊屬(*Anopheles* Spp.)(蚊蟲)、家蚊屬(*Culex* Spp.)(蚊蟲)、綠頭蒼蠅屬(*Lucillia* spp.)(麗蠅(*blowflies*))、德國蟑螂(*Blattella germanica*)(蟑螂)、美洲蟑螂(*Periplaneta americana*)(蟑螂)、東方蟑螂(*Blatta orientalis*)(蟑螂)、澳白蟻科(*Mastotermitidae*)(例如

Mastotermes spp.)、蘋白蟻科(Kalotermitidae)(例如新白蟻屬(Neotermes spp.))、鼻白蟻科(Rhinotermitidae)(例如家白蟻(Coptotermes formosanus)、黃胸散白蟻(Reticulitermes flavipes)、R. speratu、R. virginicus、西方犀白蟻(R. hesperus)和桑特散白蟻(R. santonensis))和白蟻科(Termitidae)(例如黃球土白蟻(Globitermes sulphureus))之白蟻、熱帶火蟻(Solenopsis geminata)(火蟻)、小黃家蟻(Monomorium pharaonis)(法老蟻)、毛蟲屬(Damalinia spp.)和長顎虱屬(Linognathus spp.)(羽虱(biting lice)和血虱(sucking lice))以及網紋野蛞蝓(Deroceras reticulatum)(slug)。

本發明因此提供一種對抗或控制昆蟲、蠕或軟體動物之方法，其包含將殺昆蟲、殺蠕或殺軟體動物有效量的式(1)化合物或包含式(1)化合物之組合物施予該有害生物，該有害生物所在地或施予容易被該有害生物攻擊的植物。式(I)化合物較佳被用於對抗昆蟲或蠕。

如本文所使用的“植物”術語包括種子、幼苗、矮叢樹或樹。

較佳具體實例中，式(I)化合物和包含此等化合物的組合物被用以下方法以對抗或控制以下之目的昆蟲：半翅目(Hemiptera)、鱗翅目(Lepidoptera)、鞘翅目(Coleoptera)、纓翅目(Thysanoptera)、雙翅目(Diptera)、蜚蠊目(Blattodea)、等翅目(Isoptera)、蚤目(Siphonaptera)、膜翅目(Hymenoptera)及/或直翅目(Orthoptera)，以及特別是對抗或控制以下之目的昆蟲：鱗翅目、纓翅目、等翅目、蚤目、

膜翅目及/或直翅目。特佳者，式(I)化合物和包含此等化合物的組合物被用對抗半翅目昆蟲。

為了將作為殺昆蟲、殺蟎、殺軟體動物或殺線蟲之化合物式(1)化合物施予有害生物、有害生物所在地、或容易受有害生物攻擊的植物，故經常將式(1)化合物調配成組合物，除了式(1)化合物之外，其包含適合的惰性稀釋劑或載體及視需要包含表面活性劑(SFA)。合適的惰性稀釋劑或載體如本文中所述，例如關於某些調配物類型，以及因此該用語包括固態稀釋劑，無機水溶性鹽，水溶性有機固以及類似者，以及簡單的稀釋劑，例如水及/或油。SFA 為能夠改良界面特性(例如液體/固體、液體/空氣或液體/液體界面)之化學品，其係藉由降低界面張力及因此導致其它特性的改變(例如分散、乳化及濕潤)。最好使所有的組合物(固體及液體調配物兩種)包含 0.0001 至 95 重量%之式(1)化合物，以 1 至 85%更佳，例如 5 至 60%。組合物通常用於控制真菌，使得式(1)化合物以每公頃計從 0.1 公斤至 10 公斤之施藥量施藥，以每公頃計從 1 公克至 6 公斤較佳，以每公頃計從 1 公克至 1 公斤更佳。

當在種子浸敷中使用時，則以每公斤種子計 0.0001 公克至 10 公克(例如 0.001 公克或 0.05 公克)之施藥量使用式(1)化合物，以 0.005 公克至 10 公克較佳，以 0.005 公克至 4 公克更佳。

在本發明的另一個觀點係提供一種殺昆蟲、殺蟎、殺軟體動物或殺線蟲的組合物，其包括殺昆蟲、殺蟎、殺軟

體動物或殺線蟲有效量之式(1)化合物及適合的載體或稀釋劑。該組合物較佳為殺昆蟲、殺蟎、殺軟體動物或殺線蟲的組合物。

在本發明還進一步的觀點係提供對抗及控制所在地的有害生物之方法，其包括以殺昆蟲、殺蟎、殺軟體動物或殺線蟲有效量之式(1)化合物處理有害生物或含有害生物所在地。此種組合物較佳被用於對抗昆蟲、蟎或線蟲。

組合物可以選自數種調配物型式，包含可粉化粉劑(DP)、可溶性粉劑(SP)、水溶性粒劑(SG)、水分散性粒劑(WG)、可濕性粉劑(WP)、粒劑(GR)(緩釋型或快釋型)、可溶性濃縮物(SL)、油溶性液劑(OL)、超低容量溶液(UL)、可乳化濃縮物(EC)、可分散濃縮物(DC)、乳液(水包油型(EW)和油包水型(EO)兩種)、微乳液(ME)、懸浮濃縮物(SC)、噴霧劑、霧化劑/煙霧調配物、膠囊懸浮液(CS)及種子處理調配物。在任何實例中所選擇的調配物型式將依據所面對的特殊目的式(1)化合物之物理、化學及生物特性而定。

可粉化粉劑(DP)的製備可藉由將式(I)化合物與一或多種固態稀釋劑(例如天然黏土、高嶺土、葉蠟石、膨潤土、氧化鋁、蒙脫土、矽藻岩、白堊土、矽藻土、磷酸鈣、碳酸鈣和鎂、硫、石灰、麵粉、滑石粉及其它有機和無機固態載體)混合及以機械研磨混合物，形成細粉末。

可溶性粉劑(SP)的製備可藉由將式(I)化合物與一或多種水溶性無機鹽類(如碳酸氫鈉、碳酸鈉或硫酸鎂)或一或多種水溶性有機固體(如多糖類)及視需要與一或多種濕潤

劑、一或多種分散劑或該等試劑之混合物混合，以改進水分散度/溶解度。接著將混合物研磨成細粉末。也可將同樣的組合物粒化形成水溶性粒劑(SG)。

可濕性粉劑(WP)的製備可藉由將式(I)化合物與一或多種固態稀釋劑或載體、一或多種濕潤劑及較佳地與一或多種分散劑及視需要與一或多種懸浮劑混合，以促進在液體中的分散。接著將混合物研磨成細粉末。也可將同樣的組合物粒化形成水分散性粒劑(WG)。

粒劑(GR)的形成或藉由將式(I)化合物與一或多種粉末狀固態稀釋劑或載體之混合物粒化，或自預形成之空白顆粒形成，其係藉由將式(1)化合物(或其在適合的試劑中的溶液)吸收在多孔顆粒物質中(如浮石、鎂鋁海泡石黏土、富勒氏(Fuller's)土、矽藻岩、矽藻土或研磨之玉米穗軸)或使式(1)化合物(或其在適合的試劑中的溶液)吸附在硬核心物質上(如砂、矽酸鹽、無機碳酸鹽、硫酸鹽或磷酸鹽)及若必要時乾燥。常用於輔助吸收或吸附之試劑包含溶劑(如脂肪族和芳香族石油溶劑、醇類、醚類、酮類和酯類)及黏著劑(如聚醋酸乙烯酯、聚乙烯醇、糖精、糖和植物油)。一或多種其它的添加劑(例如乳化劑、濕潤劑或分散劑)也可以包含在粒劑中。

可分散濃縮物(DC)的製備可藉由將殺害活性成份溶解在水或有機溶劑中(如酮、醇或乙二醇醚)。這些溶液可以包含表面活性劑(例如為了改進在噴霧桶中的水稀釋或預防結晶)。

可乳化濃縮物(EC)或水包油型乳液(EW)的製備可藉由將殺害活性成份溶解在有機溶劑中(視需要包含一或多種濕潤劑、一或多種乳化劑或該等試劑之混合物)。適合在 EC 中使用的有機溶劑包含芳香族烴類(如烷基苯或烷基萘，以 SOLVESSO 100、SOLVESSO 150 和 SOLVESSO 200 為實例；SOLVESSO 為登記的商標)、酮類(如環己酮或甲基環己酮)、醇類(如苯甲醇、糠醇或丁醇)、N-烷基吡咯啉酮類(如 N-甲基吡咯啉酮或 N-辛基吡咯啉酮)、脂肪酸之二甲基鹽胺類(如 C₈-C₁₀ 脂肪酸二甲基甲鹽胺)及氯化烴類。可將 EC 產品在加入水時自發性乳化，產生具有充份穩定性之乳液，允許經由適當的設備噴霧施藥。EW 之製備作用包含獲得或成為液體之殺害活性成份(假設其在室溫下不是液體，但是其可在合理的溫度下熔融，典型係小於 70°C)或在溶液中的殺害活性成份(藉由將其溶解在適當的溶劑中)及接著將所得液體或溶液在高切變下乳化在含有一或多種 SFA 之水中，以產生乳液。適合在 EW 中使用的溶劑包含植物油、氯化烴類(如氯苯)、芳香族溶劑(如烷基苯或烷基萘)及在水中具有低溶解度的其它適當的有機溶劑。在特佳的具體實例中，式 I 化合物將被調配成為 EC 或 EW 調配物。

微乳液(ME)的製備可藉由將水與一或多種溶劑與一或多種 SFA 之摻合物混合，以自發性產生熱力學上穩定的等向性液體調配物。式(I)化合物初期存在於或水或溶劑/SFA 摻合劑中。適合在 ME 中使用的溶劑包含那些用於 EC 或 EW 中所述之溶劑。ME 可為或水包油型或油包水型系統(所存

在的系統可由導電度測量決定)，並可以適合在相同的調配物中與水溶性及油溶性殺蟲劑混合。ME 適合在水中稀釋，或維持成微乳液或形成慣用的水包油型乳液。

懸浮濃縮物(SC)可以包含細碎的不溶性固體粒子之式(1)化合物的水性或非水性懸浮液。SC 的製備可藉由將式(1)化合物在適合的介質中視需要與一或多種分散劑以球或珠研磨，以產生化合物的細粒子懸浮液。一或多種濕潤劑可以包含在組合物中，並可以含懸浮液，以減低粒子的沉降速度。另一選擇係可將殺害活性成份乾研磨及加入包含上述試劑之水中，以產生希望的最終產品。

噴霧調配物包含殺害活性成份及適合的推進劑(例如正丁烷)。也可將式(I)化合物溶解或分散在適合的介質中(例如水或水互溶性液體，如正丙醇)，以提供在未施壓之手動式噴霧幫浦中使用的組合物。

可將式(I)化合物以乾燥狀態與爆破混合物混合，形成適合在封閉的空間中產生含有化合物之煙霧的組合物。

膠囊懸浮液(CS)的製備可藉由類似於製備 EW 調配物之方式，但是以額外的聚合階段得以獲得油小滴的水性分散液，其中將每一個油小滴以聚合殼包膠，並包含殺害活性成份及視需要包含其載體或稀釋劑。聚合殼或以界面聚濃縮反應或以凝聚步驟製造。組合物可以提供經控制釋放的式(1)化合物，並可用於種子處理。也可將式(1)化合物調配在生物可降解之聚合物基質中，以提供緩慢且經控制釋放的化合物。

組合物可以包含一或多種添加劑，以改進組合物的生物性能(例如藉由改進濕潤、持著性或在表面上的分布；在處理之表面上的防雨性；或殺害活性成份的吸收或移動性)。這些添加劑包含表面活性劑、以油為主之噴霧添加劑，例如特定的礦物油或天然植物油(如大豆和油菜籽油)及彼等與其它的生物增強佐劑(可以輔助或改良殺害活性成份作用的成分)之摻合劑。

在特佳的具體實例中，式(I)化合物將被調配成為 EC 或 EW 調配物。

也可將式(1)化合物調配用於種子處理，例如成為粉劑組合物(包含用於乾種子處理(DS)之粉劑、水溶性粉劑(SS)或用於漿料處理之水分散性粉劑(WS))或成為液體組合物(包含可流動濃縮物(FS)、溶液(LS)或膠囊懸浮液(CS))。DS、SS、WS、FS 及 LS 組合物之製備法分別非常類似於上述的 DP、SP、WP、SC 及 DC 組合物的那些製備法。用於處理種子之組合物可以包含有助於組合物與種子黏著的試劑(例如礦物油或膜形成阻劑)。

濕潤劑、分散劑及乳化劑可為陽離子、陰離子、兩性或非離子型 SFA。

適合的陽離子型 SFA 包含四級銨化合物(例如溴化鯨蠟基三甲基銨)、咪唑啉及胺鹽類。

適合的陰離子 SFA 包含脂肪酸之鹼金屬鹽類、硫酸的脂肪族單酯之鹽類(例如月桂基硫酸鈉)、磺酸化芳香族化合物之鹽類(例如十二烷基苯磺酸鈉、十二烷基苯磺酸鈣、丁

基萘磺酸鹽及二-異丙基-與三-異丙基-萘磺酸鈉之混合物)、醚硫酸鹽、醇醚硫酸鹽(例如月桂醇聚氧乙烯醚-3-硫酸鈉)、醚羧酸鹽(例如月桂醇聚氧乙烯醚-3-羧酸鈉)、磷酸酯(來自一或多種脂肪醇與磷酸(以單酯優先)或五氧化二磷(以二酯優先)之間反應的產物,例如在月桂醇與四磷酸之間的反應,此外可將這些產物乙氧基化)、磺基琥珀醯胺酸鹽、石蠟或烯烴磺酸鹽、牛脂酸鹽及木質磺酸鹽。

適合的兩性型 SFA 包含甜菜鹼、丙酸鹽及甘胺酸鹽。

適合的非離子型 SFA 包含環氧烷烴(如環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物)與脂肪醇(如油醇或鯨蠟醇)或與烷基酚(如辛酚、壬酚或辛基甲酚)之濃縮產物、衍生自長鏈脂肪酸或己糖醇酐之部分酯類、該部分酯類與環氧乙烷之濃縮產物、嵌段聚合物(其包含環氧乙烷和環氧丙烷)、烷醇醯胺類、單酯類(例如脂肪酸聚乙二醇酯)、胺氧化物(例如月桂基二甲胺氧化物)及卵磷脂。

適合的懸浮劑包括親脂性膠體(如多糖類、聚乙炔基吡咯啉酮或羧甲基纖維素鈉)及膨脹黏土(如膨潤土或鎂鋁海泡石)。

可將式(1)化合物以任何已知施予殺害化合物的方式施藥。例如,可將經調配或未經調配之化合物施予有害生物或有害生物之區域(例如有害生物住所,或易受有害生物感染之生長植物)或施予植物的任何部分(包括葉片、梗、分枝或根部)、在種植之前的種子或其它使植物生長或種植之介質(如圍繞根部的土壤,一般為土壤、稻田水或水栽培育系

統)，或可將其噴霧或灑粉在土壤中或水性環境上，將其以浸泡施藥、以乳膏或糊料調配物施藥、以蒸氣施藥或經由分配或併入組合物中(如粒劑組合物或包裝在水溶性袋子中的組合物)而施藥在土壤中或水性環境中。

也可將式(1)化合物注入植物中或使用電力學噴霧技術或其它的低容量法噴霧在生長植物上，或以地面或空中灌溉系統施藥。

用作水性製劑的組合物(水溶液或分散液)通常以含有高比例的活性成分的濃縮物形式供應，將濃縮物在使用之前加入水中。這些可以包括 DC、SC、EC、EW、ME、SG、SP、WP、WG 及 CS 之濃縮物常需要耐得住長期貯存，並在這樣貯存之後，能夠將其加入水中形成水性製劑，其維持充分時間使彼等能夠以慣用的噴霧設備施藥的均勻性。這些水性製劑可以包含不同的式(1)化合物量(例如 0.0001 至 10 重量%)，其係依據使用彼等的目的而定。

式(1)化合物可以用在與肥料(例如含氮-、鉀-或磷-之肥料)的混合物中。適合的調配物型式包括肥料粒劑。混合物適合包含高達 25 重量%之式(1)化合物。

本發明因此也提供含有肥料及式(1)化合物之肥料組合物。

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

式(1)化合物可為組合物中唯一的活性成分或可與一或

多種額外的活性成分摻合，如在適當情況下的殺蟲劑、殺真菌劑、協力劑、除草劑或植物生長調節劑。額外的活性成分可以：提供具有更寬的光譜活性或增加在所在地的持續性之組合物；協乘式(1)化合物的活性或補充其活性(例如以增加作用速度或克服排斥性)；或有助於克服或避免個別組份發生抗性。特殊額外的活性成分將依據所希望的組合物應用而定。適當殺蟲劑的例子包括下列：

a) 合成除蟲菊精類 (pyrethroid)，例如百滅寧 (permethrin)、賽滅寧 (cypermethrin)、芬化利 (fenvalerate)、益化利 (esfenvalerate)、第滅寧 (deltamethrin)、賽洛寧 (cyhalothrin)(特別是 δ -賽洛寧 (lambda-cyhalothrin))、畢芬寧 (bifenthrin)、芬普寧 (fenpropathrin)、賽扶寧 (cyfluthrin)、太氟寧 (tefluthrin)、魚安全合成除蟲菊精類(例如埃索芬普 (ethofenprox))、天然除蟲菊精 (pyrethrin)、治滅寧 (tetramethrin)、右亞列寧 (s-bioallethrin)、芬福寧 (fenfluthrin)、炔丙菊酯 (prallethrin) 或 5-苯甲基-3-呋喃甲基-(E)-(1R,3S)-2,2-二甲基-3-(2-亞氧硫雜環戊 (oxothiolan)-3-基甲基)環丙烷羧酸酯；

b) 有機磷酸鹽類，例如，佈飛松 (Profenofos)、蘇佈松 (sulprofos)、毆殺松 (acephate)、甲基巴拉松 (methyl parathion)、谷速松 (azinphos-methyl)、滅賜松 (demeton-s-methyl)、飛達松 (heptenophos)、硫滅松 (thiometon)、芬滅松 (fenamiphos)、亞素靈 (monocrotophos)、佈飛松 (profenofos)、三落松 (triazophos)、達馬松

(methamidophos)、大滅松(dimethoate)、福賜米松(phosphamidon)、馬拉松(malathion)、陶斯松(chlorpyrifos)、裕必松(phosalone)、托福松(terbufos)、繁福松(fensulfothion)、大福松(fonofos)、福瑞松(phorate)、巴賽松(phoxim)、亞特松(pirimiphos-methyl)、必滅松(pirimiphos-ethyl)、撲滅松(fenitrothion)、福賽絕(fosthiazate)或大利松(diazinon)；

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

d) 苯甲醯類，例如二福隆(diflubenzuron)、三福隆(triflumuron)、六伏隆(hexaflumuron)、氟芬隆(flufenoxuron)或克福隆(chlorfluazuron)；

e) 有機錫化合物，例如錫蟎丹(cyhexatin)、芬佈賜(fenbutatin-oxide)或亞環錫(azocyclotin)；

f) 吡唑類，例如替布芬比(tebufenpyrad)和芬普蟎(fenpyroximate)；

g) 大環內酯類，例如阿凡曼菌素(ivermectin)或米貝黴素類(milbemycins)，例如阿巴汀(abamectin)、因滅汀(emamectin benzoate)、伊維菌素(ivermectin)、米貝黴素

(milbemycin)、賜諾殺(spinosad)或印楝素(azadirachtin)；

h) 激素類或費洛蒙類；

i) 有機氯化化合物例如安殺番(endosulfan)、六氯化苯、DDT、克氯丹(chlordane)或地特靈(dieldrin)；

j) 脘類，例如氯苯甲脘(chlordimeform)或三亞蟎(amitraz)；

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

l) 氯菸鹼基化合物例如益達胺(imidacloprid)、賽克培(Thiacloprid)、亞滅培(acetamiprid)、耐特必爛(nitenpyram)、達特南(dinotefuran)、賽速安(thiamethoxam)或蘇福羅(sulfoxaflor)；

m) 二醯基肼類，例如得芬諾(tebufenozide)、環蟲肼(chromafenozide)或甲氧芬立(methoxyfenozide)；

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

o) 因得克(Indoxacarb)；

p) 克凡派(Chlorfenapyr)，特別是克凡派二水合物；

q) 比內秋(Pyrnetrozine)；

r) 4-羥乙酰乙酸內酯(Tetronic acid)，例如螺蟲乙酯(spirotetramat)、季酮蟎酯(spirodiclofen)或螺甲蟎酯(Spiromesifen)；

s) 賜諾殺(Spinosyns)，例如多殺菌素(Spinosad)或多殺菌(spinetoram)；或

t) 鄰甲酰氨基苯甲酰胺類 (anthranilic diamides)，例如含氟蟲酰胺(flubendiamide)、CyazypyrTM 或 RynaxypyrTM。

除上列殺蟲劑之主要化學類別之外，其他具有特別目的之殺蟲劑可使用於組合物中，如果對於所欲之組合物的利用性適當的話。例如，可使用特定作物之視需要的殺蟲劑，例如鑽心蟲(stemborer)特殊殺蟲劑(例如培丹(cartap))或使用於米的飛蟲特殊殺蟲劑(例如布芬淨(buprofezin))。或者對特定昆蟲的種類／階段有特異性之殺蟲劑或殺蟎劑也可包含在組合物中(例如殺蟎卵-幼蟲劑，例如，例如克芬蟎(clofentezine)、氟苯米(flubenzimine)、合賽多(hexythiazox)或得脫蟎(Tetradifon)；motilicides，例如大克蟎(dicofol)或毆蟎多(propargite)；殺蟎劑，例如新殺蟎(bromopropylate)或克氯苯(chlorobenzilate)；或生長調節劑，例如愛美松(hydramethylnon)、賽滅淨(cyromazine)、甲氧普烯(methoprene)、克福隆(chlorfluazuron)或二福隆(diflubenzuron))。

可包括在本發明組合物之殺真菌劑的例子為(E)-N-甲基-2-[2-(2,5-二甲基苯氧基甲基)苯基]-2-甲氧基-亞胺基乙醯胺基(SSF-129)、4-溴基-2-氟基-N,N-二甲基-6-三氟甲基苯並咪唑-1-磺醯胺、 α -[N-(3-氟基-2,6-二甲苯基)-2-甲氧基乙醯胺基]- γ -丁內酯、4-氟基-2-氟基-N,N-二甲基-5-對-甲苯基咪唑-1-磺醯胺(IKF-916)、斯美達沙米(cyamidazosulfamid)、3-5-二氟基-N-(3-氟基-1-乙基-1-甲基-2-酮基丙基)-4-甲基苯甲醯胺(RH-7281、佐殺滅

(Zoxamide))、N-烯丙基-4,5,-二甲基-2-三甲基甲矽烷基噻吩-3-羧醯胺(MON65500)、N-(1-氰基-1,2-二甲基丙基)-2-(2,4-二氯苯氧基)丙醯胺(AC382042)、N-(2-甲氧基-5-吡啶基)-環丙烷羧醯胺、阿昔貝拉(acibenzolar)(CGA245704)、棉鈴威(alanycarb)、阿地莫非(aldimorph)、敵菌靈(anilazine)、阿扎康唑(azaconazole)、亞托敏(azoxystrobin)、本達樂(benalaxyl)、免賴得(benomyl)、惡霜靈(biloxazol)、比多農(bitertanol)、保米黴素(blasticidin S)、溴克座(bromuconazole)、布瑞莫(bupirimate)、四氯丹(captafol)、蓋普丹(captan)、貝芬替(carbendazim)、貝芬替氫氯酸鹽(chlorhydrate)、萎鏽靈(carboxin)、加普胺(carpropamid)、香芹酮(carvone)、CGA41396、CGA41397、甲基克殺蟎(chinomethionate)、四氯異苯(chlorothalonil)、氯諾立那(chlorozolate)、克拉康(clozylacon)、含銅化合物例如氯氧化銅(copper oxychloride)、氧基氫醌銅(copper oxyquinolate)、硫酸銅、樹脂酸銅(copper tallate)和波爾多(Bordeaux)混合物、克絕(cymoxanil)、環克座(cyproconazole)、賽普洛(cyprodinil)、得巴卡(debacarb)、二-2-吡啶基二硫化物 1,1'-二氧化物、益發靈(dichlofluanid)、達滅淨(Diclomezine)、大克爛(dicloran)、鮑滅爾(diethofencarb)、待克利(difenoconazole)、燕麥枯(difenzoquat)、二氟林(diflumetorim)、硫代磷酸 O,O'-二-異-丙基-S-苯甲基酯、地美福唑(dimefluazole)、地美康唑(dimetconazole)、達滅芬(dimethomorph)、二甲嘧吩

(dimethirimol)、達克利(diniconazole)、白粉克(dinocap)、
 腈硫醯(dithianon)、氯化十二基二甲基銨、十二環嗎啉
 (dodemorph)、多寧(dodine)、多瓜地(dogvadine)、護粒松
 (edifenphos)、依普座(epoxiconazole)、依瑞莫(ethirimol)、
 (Z)-N-苯甲基-N([甲基(甲基-硫亞乙基胺氧羰基)胺基]硫
 基)- β -丙胺酸乙酯、依得利(etridiazole)、凡殺多
 (famoxadone)、芬滅多(fenamidone)(RPA407213)、芬瑞莫
 (fenarimol)、芬克座(fenbuconazole)、芬福瑞(fenfuram)、芬
 海米(fenhexamid)(KBR2738)、芬哌克尼(fenpiclonil)、芬撲
 定(fenpropidin)、芬必莫(fenpropimorph)、三苯醋錫(fentin
 acetate)、三苯羥錫(fentin hydroxide)、富爾邦(ferbarn)、噻
 菌脲(ferimzone)、扶吉胺(fluazinam)、護汰寧(fludioxonil)、
 氟美托(flumetover)、氟美地(fluoroimide)、氟喹康唑
 (fluquinconazole)、護矽得(flusilazole)、福多寧(flutolanil)、
 護汰芬(flutriafol)、福爾培(folpet)、麥穗寧(fuberidazole)、
 福拉斯(furalaxyl)、福拉比(furametpyr)、克熱淨
 (guazatine)、菲克利(hexaconazole)、羥基異噁唑、殺紋寧
 (hymexazole)、依滅列(imazalil)、易胺座(imibenconazole)、
 雙胍辛胺(iminoctadine)、雙胍辛胺三乙酸鹽、依康唑
 (ipconazole)、丙基喜樂松(iprobenfos)、依普同(iprodione)、
 依普瓦立(iprovalicarb)(SZX0722)、異丙基丁基胺基甲酸
 酯、亞賜圃(isoprothiolane)、嘉賜黴素(kasugamycin)、克收
 欣(kresoxim-methyl)、LYI 86054、LY211795、LY248908、
 鋅錳乃浦(mancozeb)、錳乃浦(maneb)、甲霜靈

(mefenoxam)、滅派林(mepanipyrim)、滅普寧(mepronil)、滅達樂(metalaxyl)、滅克座(metconazole)、免得爛(metiram)、免得爛-鋅、苯氧菌胺(metominostrobin)、邁克尼(myclobutanil)、尼索立(neoasozin)、二甲基二硫代胺基甲酸鎳、尼秋沙(nitrothal)-異丙基、尼瑞莫(nuarimol)、歐福拉(ofurace)、有機汞化合物、歐殺斯(oxadixyl)、氧殺福隆(oxasulfuron)、歐林索酸(oxolinic acid)、歐伯克座(oxpoconazole)、嘉保信(oxycarboxin)、披扶座(pefurazoate)、平克座(penconazole)、賓克隆(pencycuron)、殺枯淨(phenazin oxide)、伏捨替(phosetyl)-Al、磷酸、熱必斯(phthalide)、吡可斯賓(picoxystrobin)(ZA1963)、保粒黴素(polyoxin) D、代森聯(polyram)、撲殺熱(probenazole)、撲克拉(prochloraz)、撲滅寧(procymidone)、普拔克(propamocarb)、普克利(propiconazole)、甲基鋅乃浦(propineb)、丙酸、白粉松(pyrazophos)、比芬諾(pyrifenox)、必滅寧(pyrimethanil)、百快隆(pyroquilon)、彼斯福(pyroxyfur)、吡咯尼群(pyrrolnitrin)、四級銨化合物、蟎離丹(quinomethionate)、奎諾斯芬(quinoxifen)、五氯硝苯(quintozene)、西克座(sipconazole)(F-155)、五氯酚鈉、螺殺胺(spiroxamine)、鏈黴素(streptomycin)、硫、得克利(tebuconazole)、克枯爛(tecloftalam)、四氯硝基苯(tecnazene)、四克利(tetraconazole)、腐絕(thiabendazole)、塞福滅(thifluzamid)、2-(硫氰基甲硫基)苯并噻唑、甲基多保淨(thiophanate-methyl)、得恩地(thiram)、替咪苯康唑

(timibenconazole)、脫克松(tolclofos-methyl)、托福寧(tolyfluanid)、三泰芬(triadimefon)、三泰隆(triadimenol)、三布替(triazbutil)、三唑氧(triazoxide)、三賽唑(tricyclazole)、三得芬(tridemorph)、三氟敏(trifloxystrobin)(CGA279202)、賽福寧(triforine)、賽福座(triflumizole)、環菌唑(triticonazole)、維利黴素A(validamycin A)、衛本(vapam)、免克寧(vinclozolin)、鋅乃浦(zineb)和福美鋅(ziram)。

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

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

包括於組合物中的合適除草劑和植物生長調節劑將視所欲目標和所需要效應而定。

可被包括的稻米視需要的除草劑之實例為除草靈(propanil)。用於棉花的植物生長調節劑之實例為 PIXTM。

一些混合物可以包含具有明顯不同的物理、化學或生物特性之活性成分，使得彼等不輕易使彼等合乎相同慣用的調配物型式。在這些情況下，可以製備其它的調配物型式。例如，在一種活性成分為不溶於水之固體及其它為不溶於水之液體時，則因此有可能使每一種活性成分分散在連續的相同水相中，其係藉由使固體活性成分分散成懸浮液(使用類似於 SC 之製備法)，但是使液體活性成分分散成乳液(使用類似於 EW 之製備法)。所得組合物為懸浮乳液(SE)

調配物。

本發明各方面內容和具體實例將以實施例方式作更詳細說明。理應理解的是，對該詳細內容的修飾不會偏離本發明的範圍。

為避免疑問，本案說明書內容所引述的文獻參考資料、專利申請案或專利，該引證案全文以引用方式併入本發明案。

實施例

實施例 1 本發明化合物的製備

實施例 1.1 2-(2-甲基-3-三氟甲基-苯氧基)-丁腈

2-(甲氧磺基氧基)-丁腈(449 毫克，2.75 毫莫耳)、2-甲基-3-二氟甲基酚(440 毫克，2.5 毫莫耳)、碳酸鉀(432 毫克，3.13 毫莫耳)和在乙腈(20 毫升)中的碘化鉀(42 毫克，0.25 毫莫耳)的混合物於 80°C 之下經攪拌隔夜。混合物於 tBuOMe 和水之間搖晃，經氯化鈉(飽和水溶液)沖洗，醚相經硫酸鎂乾燥及蒸發。粗製材料於矽膠上經層析(乙酸乙酯/己烷)而得到為 2-(2-甲基-3-三氟甲基-苯氧基)-丁腈。¹H-NMR(CDCl₃) 1.20, t, 3H; 2.15, dt, 2H; 2.36, s, 3H; 4.75, t, 2H; 7.17, d, 1H; 7.28, t, 1H; 7.37, d, 1H。

實施例 1.2 2-[1-(2-甲基-3-三氟甲基-苯氧基)-丙基]-4,5-二氫-1H-咪唑

2-(2-甲基-3-三氟甲基-苯氧基)-丁腈(192 毫克，0.790 毫莫耳)、乙二胺(0.216 毫升，3.16 毫莫耳)和四硫化鈉(7 毫克，0.04 毫莫耳)的混合物於 75°C 之下經攪拌 4 小時，然後

經冷卻，以及與水(約 6 毫升)攪拌。濾除固體，以水沖洗，於真空中乾燥，製得 2-[1-(2-甲基-3-三氟甲基-苯氧基)-丙基]-4,5-二氫-1H-咪唑(熔點為 120 至 122°C)。

實施例 2 生物功效

此實施例例示式(I)的殺害/殺昆蟲性質。化合物經證實關於位於表中(即表 3 和 4)特徵數據。如下所述進行對抗各種不同有害生物種類的試驗。

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

將卵(0 至 24 小時大)置於在人造飲食的 24 井微量滴定平盤上且藉吸液器使其以 200ppm 投與率經試驗溶液處理。在培育 4 天之後，檢視樣品之卵死亡率、幼蟲死亡率和生長調節。下列化合物產生 100% 控制：1.016, 1.020 和 1.024。下列化合物產生 80% 控制：1.001, 1.003 和 1.022。下列化合物產生 50% 控制：1.004, 1.007 和 1.014。

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

向日葵葉圓盤被放置於 24 井微量滴定平盤中的瓊脂上及以 200ppm 的投與率試驗溶液噴霧。在乾燥之後，將葉片圓盤以混合年紀的蚜族群感染。在培育 6DAT 之後，檢視樣品的死亡率。下列化合物產生 100% 控制：1.001, 1.003, 1.004, 1.005, 1.006, 1.007, 1.008, 1.016, 1.017, 1.019, 1.021, 1.023 和 1.024。下列化合物產生 80% 控制：1.002

和 1.026。下列化合物產生 50% 控制：1.010，1.018，1.025 和 1.027。

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

經混合年紀蚜族群感染的豌豆苗根被直接置於 24ppm 試驗溶液中。置入 6 天後，檢視樣品死亡率。下列化合物產生 100% 控制：1.001，1.003，1.016，1.021，1.022 和 1.024。下列化合物產生 80% 控制：1.005，1.019，1.020 和 1.023。

2.4 二斑葉蟎 (*Tetranychus urticae*)(two-spotted mite)

被放置於 24 井微量滴定平盤中的瓊脂上的豆葉圓盤被投與 200ppm 的試驗溶液噴霧。在乾燥之後，將葉片圓盤以混合年紀的蟎族群感染。在 8 天之後，檢視圓盤卵的死亡率、幼蟲死亡率和成蟲死亡率。下列化合物產生 100% 控制：1.001，1.003，1.004，1.005，1.007，1.016，1.021，1.022，1.023 和 1.024。下列化合物產生 80% 控制：1.019，1.025 和 1.027。

【圖式簡單說明】

無

【主要元件符號說明】

無

五、中文發明摘要：

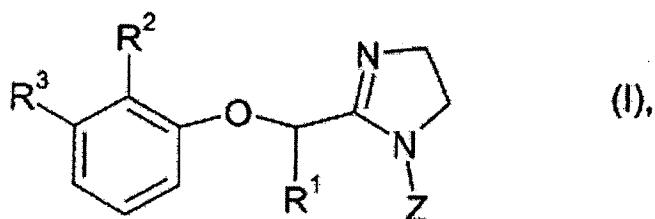
本發明係關於新穎咪唑啉衍生物以及其作為殺昆蟲劑、殺蟎劑、殺軟體動物劑和殺線蟲劑的用途。本發明亦關於包括此等咪唑啉衍生物的殺昆蟲和殺蟎、殺軟體動物和殺線蟲的組合物，以及使用此等衍生物及/或組合物對抗和控制昆蟲、蟎、軟體動物和線蟲的有害生物方法。

六、英文發明摘要：

The present invention relates to novel imidazoline derivatives and their use as insecticidal, acaricidal, molluscicidal and nematocidal agents. The invention also extends to insecticidal, acaricidal, molluscicidal and nematocidal compositions comprising such imidazoline derivatives, and to methods of using such derivatives and/or compositions to combat and control insect, acarine, mollusk and nematode pests.

十、申請專利範圍：

1. 一種式 (I) 化合物



或其鹽類或 N-氧化物，其中

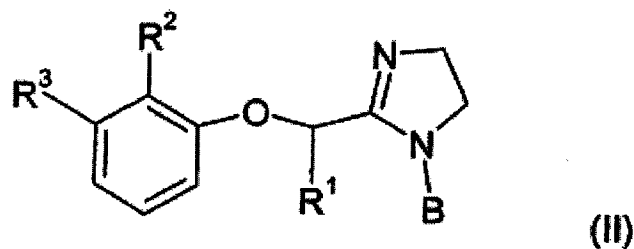
R¹ 為 C₁₋₁₀ 烷基；

R^2 為 C_{1-5} 烷基， C_{1-5} 鹵烷基， C_{1-5} 羥基烷基， C_{2-5} 烯基， C_{2-5} 鹵烯基， C_{2-5} 炔基， C_{3-6} 環烷基， C_{1-5} 烷氧基， C_{1-5} 鹵烷氧基， C_{1-3} 烷氧基(C_{1-3} 烷基)， C_{1-3} 烷氧基(C_{2-3})烯基， C_{1-5} 烷基硫基， C_{1-5} 鹵烷基硫基， C_{1-5} 烷基亞磺醯基， C_{1-5} 烷基磺醯基，氰基，硝基，甲醯基，或 $-CH=N-R^{18}$ 基團，其中 R^{18} 為羥基或 C_{1-3} 烷氧基；

R^3 為 C_{1-5} 鹵烷基；

Z 為 氫， 羥 基， 硝 基， 氰 基， 羅 丹 諾 基(rhodano)， 甲 醯 基， G-， G-S-， G-S-S-， G-A-， R^7R^8N- ， R^7R^8N-S- ， R^7R^8N-A- ， G-O-A-， G-S-A-， $(R^{10}O)(R^{11}O)P(X)-$ ， $(R^{10}O)(R^{11}S)P(X)-$ ， $(R^{10}O)(R^{11})P(X)-$ ， $(R^{10}S)(R^{11}S)P(X)-$ ， $(R^{10}O)(R^{14}R^{15}N)P(X)-$ ， $(R^{11})(R^{14}R^{15}N)P(X)-$ ， $(R^{14}R^{15}N)(R^{16}R^{17}N)P(X)-$ ， G-N=CH-， G-O-N=CH-， $N \equiv C-N=CH-$ ， 或

Z 為下式 (II) 基團



其中 B 為 S-，S-S-，S(O)-，C(O)-，或 $(CH_2)_n-$ ，n 為 1 至 6(含)的整數； R^1 ， R^2 和 R^3 定義如上，以及

G 為視需要經取代的 C_{1-10} 烷基，視需要經取代的 C_{2-10} 烯基，視需要經取代的 C_{2-60} 炔基，視需要經取代的 C_{3-7} 環烷基，視需要經取代的 C_{3-7} 環烯基，視需要經取代的芳基，視需要經取代的雜芳基或視需要經取代的雜環基；

A 為 S(O)， SO_2 ，C(O)或 C(S)；

R^7 和 R^8 係獨立地為氫或 G；或 R^7 和 R^8 係一起與其所連接的 N 原子形成 $N=CR^{12}R^{13}$ 基團；或 R^7 和 R^8 係一起與其所連接的 N 原子形成 5、6 或 7 員雜環狀環，其雜環狀環視需要包含一或二個另外的選自 O、N 或 S 的雜原子，且係視需要經一或二個 C_{1-6} 烷基所取代；

R^{10} 和 R^{11} 係獨立地為 C_{1-6} 烷基，苄基或苯基，其中苯基視需要經鹵素，硝基，氰基， C_{1-3} 烷基， C_{1-3} 鹵烷基， C_{1-3} 烷氧基， C_{1-3} 鹵烷氧基；

R^{12} ， R^{13} ， R^{14} ， R^{15} ， R^{16} 及 R^{17} 係獨立地為氫或 C_{1-6} 烷基；

X 為 O 或 S。

2.根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 R^3 為 C_{1-2} 鹵烷基。

3.根據申請專利範圍第 2 項之化合物，其中 R^3 為氟甲基，二氟甲基或三氟甲基。

4.根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 R^2 係為 C_{1-2}

烷基，環丙基， C_{1-2} 鹵烷基， C_{2-3} 烯基， C_{2-3} 鹵烯基或 $-CH=NR^{18}$ 基團，其中 R^{18} 係為羥基或甲氧基。

5. 根據申請專利範圍第 4 項之化合物，其中 R^2 係為甲基。

6. 根據申請專利範圍第 1 至 5 項中任一項之化合物，其中 R^1 係為 C_{1-5} 烷基且 Z 為選自氫；氟基；甲酯基；視需要經取代的 C_{1-6} 烷基； C_{3-6} 烯基； C_{3-6} 鹵烯基； C_{3-6} 炔基； C_{1-6} 烷基硫基； C_{1-6} 鹵烷基硫基； C_{1-6} 氟基烷基硫基；視需要經取代的苯基硫基，其中該取代基係選自鹵素，硝基，氟基， C_{1-3} 烷基和 C_{1-3} 烷氧基； C_{1-6} 烷基二硫基；二(C_{1-4} 烷基)胺基硫基；視需要經取代的 C_{1-6} 烷基羰基，其中該取代基係選自鹵素，氟基和 C_{1-3} 烷氧基； C_{2-6} 烯基羰基； C_{3-6} 環烷基羰基；視需要經取代的苯基羰基，鹵素，硝基，氟基， C_{1-3} 烷基和 C_{1-3} 烷氧基；視需要經取代的雜芳基羰基，其中該取代基係選自鹵素，硝基，氟基， C_{1-3} 烷基和 C_{1-3} 烷氧基； C_{1-6} 烷氧基羰基； C_{1-6} 烷基硫基羰基；視需要經取代的苯基硫基羰基，其中該取代基係選自鹵素，硝基，氟基， C_{1-3} 烷基和 C_{1-3} 烷氧基； N,N -二 C_{1-3} 烷基胺基羰基； C_{1-3} 烷基胺基羰基； C_{3-5} 烯基胺基羰基； C_{3-5} 炔基胺基羰基；苯基胺基羰基，其中苯基視需要經鹵素，硝基，氟基， C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 烷氧基取代； N -苯基- N -甲基胺基羰基，其中苯基視需要經鹵素，硝基，氟基， C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 烷氧基取代； C_{1-6} 烷氧基硫基羰基； C_{1-6} 烷基硫基硫基羰基；視需要經取代的苯基硫基硫基羰基，其中該取代基係選自鹵素，硝基，

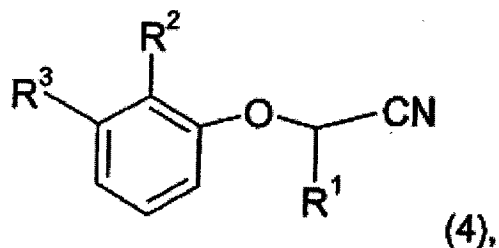
氰基， C_{1-3} 烷基和 C_{1-3} 烷氧基；N,N-二 C_{1-3} 烷基胺基硫羰基
 羰基；苯基胺基硫羰基羰基，其中苯基視需要經鹵素，硝
 基，氰基， C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 烷氧基取代；N-苯基-N-甲基胺
 基硫羰基羰基，其中苯基視需要經鹵素，硝基，氰基， C_{1-3}
 烷基或 C_{1-3} 烷氧基取代； C_{1-3} 烷基磺醯基； C_{1-3} 鹵烷基磺醯
 基； C_{1-3} 烯基磺醯基；視需要經取代的苯基磺醯基，其中該
 取代基係選自鹵素，硝基，氰基， C_{1-3} 烷基和 C_{1-3} 烷氧基；
 N,N-二 C_{1-3} 烷基胺基磺醯基；二 C_{1-3} 烷氧基-P(=O)-；二 C_{1-3}
 烷基硫基-P(=O)-；二 C_{1-3} 烷氧基-P(=S)-，二 C_{1-3} 烷基硫基
 -P(=S)-，(C_{1-3} 烷氧基)-(苯基)P(=O)-，(C_{1-3} 烷氧基)(苯
 基)(P(=S)-， C_{1-3} 烷基-N=CH-， C_{1-3} 烷氧基-N=CH-，氰基
 -N=CH-，苯基-N=CH-(其中苯基視需要經鹵素，硝基，氰基，
 或 C_{1-3} 烷氧基取代)，2-吡啶基-N=CH-，3-吡啶基-N=CH-，
 2-噻唑基-N=CH-，或之前所述式(II)化合物(其中 B 係為 S-
 或 CH-)；

以及其中 Z 為視需要經取代 C_{1-6} 烷基，其中該取代基
 係選自 1 至 7 個氟原子；1 至 3 個氯原子；1 至 3 個溴原子；
 氰基；1 至 2 個 C_{1-3} 烷氧基； C_{1-3} 鹵烷氧基； C_{1-3} 烷基硫基；
 C_{1-3} 鹵烷基硫基；烯丙基氧基；丙炔基氧基； C_{3-6} 環烷基；
 苯基，其中該苯基係視需要經鹵素；硝基，氰基， C_{1-3} 烷基
 或 C_{1-3} 烷氧基取代； C_{1-3} 烷基羰基氧基； C_{1-3} 烷氧基羰基；
 C_{1-3} 烷基羰基；視需要經取代的苯甲醯基，該取代基係選自
 鹵素，硝基， C_{1-3} 烷基， C_{1-3} 烷氧基以及氰基。

7. 根據申請專利範圍第 6 項之化合物，其中 Z 係為氫。

8. 一種殺昆蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物的組合物，其包括根據申請專利範圍第 1 至 7 項中任一項之化合物、鹽或 N-氧化物，以及惰性稀釋劑或載劑。

9. 一種製備根據申請專利範圍第 1 項之式(1)化合物之方法，其包括使式(4)化合物

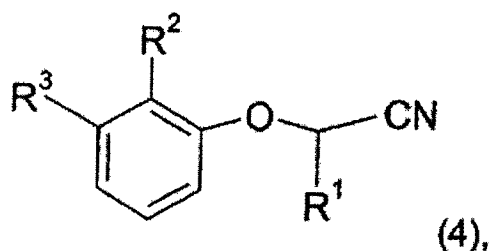


其中 R^1 , R^2 和 R^3 係根據申請專利範圍第 1 項所定義，與式(5)二胺



其中 Z 係根據申請專利範圍第 1 項所定義，其係在觸媒存在下反應。

10. 一種式(4)化合物



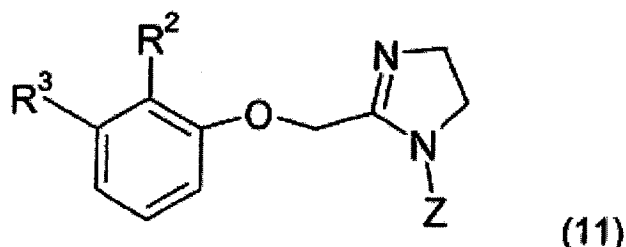
R^1 為 C_{1-10} 烷基；

R^2 為 C_{1-5} 烷基， C_{1-5} 鹵烷基， C_{1-5} 羥基烷基， C_{2-5} 烯基， C_{2-5} 鹵烯基， C_{2-5} 炔基， C_{3-6} 環烷基， C_{1-5} 烷氧基， C_{1-5} 鹵烷氧基， C_{1-3} 烷氧基(C_{1-3} 烷基)， C_{1-3} 烷氧基(C_{2-3})烯基， C_{1-5} 烷基硫基， C_{1-5} 鹵烷基硫基， C_{1-5} 烷基亞磺醯基， C_{1-5} 烷基

磺醯基，氰基，硝基，甲醯基，或 $-\text{CH}=\text{N}-\text{R}^{18}$ 基團，其中 R^{18} 為羥基或 C_{1-3} 烷氧基；及

R^3 為 C_{1-5} 鹵烷基，羥基- C_{1-6} 烷基或甲醯基。

11. 一種式(11)化合物



R^3 和 Z 係根據申請專利範圍第 1 項所定義，且 R^2 係選自： C_{1-5} 烷基， C_{1-5} 鹵烷基， C_{1-5} 羥基烷基， C_{2-5} 烯基， C_{2-5} 鹵烯基， C_{2-5} 炔基， C_{3-6} 環烷基， C_{1-5} 烷氧基， C_{1-5} 鹵烷氧基， C_{1-3} 烷氧基(C_{1-3} 烷基)， C_{1-3} 烷氧基(C_{2-3})烯基， C_{1-5} 烷基硫基， C_{1-5} 鹵烷基硫基， C_{1-5} 烷基亞磺醯基， C_{1-5} 烷基磺醯基，氰基，硝基，甲醯基，或 $-\text{CH}=\text{N}-\text{R}^{18}$ 基團，其中 R^{18} 為羥基或 C_{1-3} 烷氧基。

12. 一種對抗及/或控制由昆蟲、蟎、線蟲和軟體動物所組成之群組的有害生物的方法，其包括對予該有害生物，該有害生物所在地或施予容易被該有害生物攻擊的植物投與根據申請專利範圍第 1 至 9 項中任一項的化合物、 N -氧化物或鹽或根據申請專利範圍第 10 項的組合物。

13. 根據申請專利範圍第 12 項的方法，其中該昆蟲係屬以下的目：半翅目(Hemiptera)、鱗翅目(Lepidoptera)、鞘翅目(Coleoptera)、纓翅目(Thysanoptera)、雙翅目(Diptera)、蜚蠊目(Blattodea)、等翅目(Isoptera)、蚤目(Siphonaptera)、膜翅目(Hymenoptera)或直翅目(Orthoptera)。

14.根據申請專利範圍第 13 項的方法，其中該昆蟲係屬以下的目：半翅目、鱗翅目、鞘翅目、纓翅目或雙翅目。

15.根據申請專利範圍第 14 項的方法，其中該昆蟲係屬半翅目。

16.根據申請專利範圍第 13 項的方法，其中該昆蟲係屬以下的目：鱗翅目、纓翅目、等翅目、蚤目、膜翅目或直翅目。

17.根據申請專利範圍第 12 項的方法，其中該有害生物係蟎。

十一、圖式：

無

14.根據申請專利範圍第 13 項的方法，其中該昆蟲係屬以下的目：半翅目、鱗翅目、鞘翅目、纓翅目或雙翅目。

15.根據申請專利範圍第 14 項的方法，其中該昆蟲係屬半翅目。

16.根據申請專利範圍第 13 項的方法，其中該昆蟲係屬以下的目：鱗翅目、纓翅目、等翅目、蚤目、膜翅目或直翅目。

17.根據申請專利範圍第 12 項的方法，其中該有害生物係蟎。

十一、圖式：

無

七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第（ 無 ）圖。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

無

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

