



(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 201016693 A1

(43)公開日：中華民國 99 (2010) 年 05 月 01 日

(21)申請案號：098120300

(22)申請日：中華民國 98 (2009) 年 06 月 17 日

(51)Int. Cl.：

C07D417/06 (2006.01)

A01N43/80 (2006.01)

A01P7/00 (2006.01)

A01P11/00 (2006.01)

A01P5/00 (2006.01)

(30)優先權：2008/06/18

美國

61/073,574

(71)申請人：巴地斯顏料化工廠(德國) BASF SE (DE)

德國

(72)發明人：凡 迪恩 沃夫崗 VON DEYN, WOLFGANG (DE)；帕爾 麥可 PUHL, MICHAEL (DE)；波曼 馬席斯 POHLMAN, MATTHIAS (DE)；拉克 麥可 RACK, MICHAEL (DE)；帕拉 拉帕都 莉莉安娜 PARRA RAPADO, LILIANA (ES)；藍傑沃德 猶庚 LANGEWALD, JUERGEN (DE)；安斯波 道格拉斯 D ANSPAUGH, DOUGLAS D. (US)；歐羅梅 薩德基 哈珊 OLOUMI-SADEGHI, HASSAN (US)；卡伯森 黛柏拉 L CULBERTSON, DEBORAH L. (US)；倫可 南西 B RANKL, NANCY B. (US)；肯普 漢尼克 KAMP, HENNICKE (DE)；凡 拉文斯 瓦伊 伯納德 VAN RAVENZWAAY, BENNARD (NL)

(74)代理人：陳長文

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：29 項 圖式數：0 共 151 頁

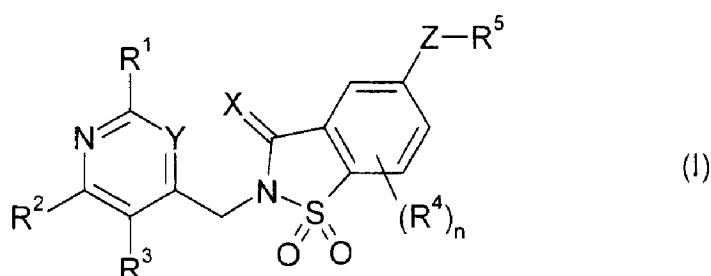
(54)名稱

磺醯胺化合物

SULFONAMIDE COMPOUNDS

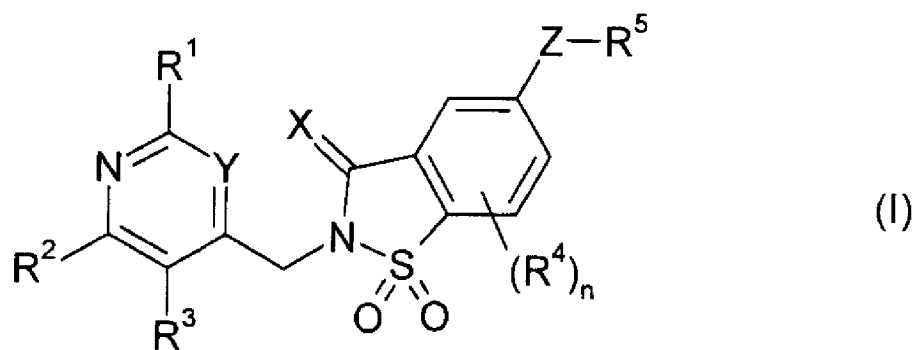
(57)摘要

本發明係關於一種式(I)磺醯胺化合物：



其中 R^1 為 H、鹵素、CN、 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_4 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_2 - C_6 烯硫基、 C_2 - C_6 炔硫基、 C_1 - C_6 鹵烷基或 C_1 - C_6 鹵烷氧基； R^2 及 R^3 為 H、鹵素、CN、 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_4 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_2 - C_6 烯硫基、 C_2 - C_6 炔硫基、 C_1 - C_6 鹵烷基或 C_1 - C_6 鹵烷氧基；或 R^2 連同 R^3 一起形成稠合之 5 員或 6 員碳環或雜環； R^4 為鹵素、CN、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6

炔基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 烷基亞磺醯基、C₁-C₆ 烷基磺醯基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₁-C₆ 鹵烷氧基、C₁-C₆ 鹵烷硫基、C₁-C₆ 鹵烷基亞磺醯基或 C₁-C₆ 鹵烷磺醯基；n 為 0、1、2 或 3；R⁵ 為苯基或 5 員或 6 員雜環；X 為 O 或 NR^x，其中 R^x 為 H、C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烯基、C₂-C₆ 炔基、C₃-C₇ 環烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₂-C₆ 烯氧基、C₂-C₆ 炔氧基、C₁-C₆ 烷基羰基或 C₁-C₆ 烷基羰氧基；Y 為 N 或 C(R^y)，其中 R^y 為 H、鹵素、CN、C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烯基、C₂-C₆ 炔基、C₃-C₇ 環烷基、C₃-7 環烷基-C₁-C₄ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₂-C₆ 烯氧基、C₂-C₆ 炔氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₂-C₆ 烯硫基、C₂-C₆ 炔硫基、C₁-C₆ 鹵烷基及 C₁-C₆ 鹵烷氧基；且 Z 為化學鍵、O 或 N(R^z)，其中 R^z 為 C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烯基、C₂-C₆ 炔基、C₃-C₇ 環烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₂-C₆ 烯氧基、C₁-C₆ 烷基羰基或 C₁-C₆ 烷基羰氧基；以及其 N-氧化物及鹽。該等化合物適用於對抗有害動物。本發明亦關於製備該等化合物之方法及該方法中所使用之中間化合物。本發明進一步關於一種藉由使用該等式(I)化合物、其 N-氧化物或鹽防治有害動物的方法，植物繁殖材料及包含該等化合物、其 N-氧化物或鹽之農業及獸醫組合物。





(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 201016693 A1

(43)公開日：中華民國 99 (2010) 年 05 月 01 日

(21)申請案號：098120300

(22)申請日：中華民國 98 (2009) 年 06 月 17 日

(51)Int. Cl.：

C07D417/06 (2006.01)

A01N43/80 (2006.01)

A01P7/00 (2006.01)

A01P11/00 (2006.01)

A01P5/00 (2006.01)

(30)優先權：2008/06/18

美國

61/073,574

(71)申請人：巴地斯顏料化工廠(德國) BASF SE (DE)

德國

(72)發明人：凡 迪恩 沃夫崗 VON DEYN, WOLFGANG (DE)；帕爾 麥可 PUHL, MICHAEL (DE)；波曼 馬席斯 POHLMAN, MATTHIAS (DE)；拉克 麥可 RACK, MICHAEL (DE)；帕拉 拉帕都 莉莉安娜 PARRA RAPADO, LILIANA (ES)；藍傑沃德 猶庚 LANGEWALD, JUERGEN (DE)；安斯波 道格拉斯 D ANSPAUGH, DOUGLAS D. (US)；歐羅梅 薩德基 哈珊 OLOUMI-SADEGHI, HASSAN (US)；卡伯森 黛柏拉 L CULBERTSON, DEBORAH L. (US)；倫可 南西 B RANKL, NANCY B. (US)；肯普 漢尼克 KAMP, HENNICKE (DE)；凡 拉文斯 瓦伊 伯納德 VAN RAVENZWAAY, BENNARD (NL)

(74)代理人：陳長文

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：29 項 圖式數：0 共 151 頁

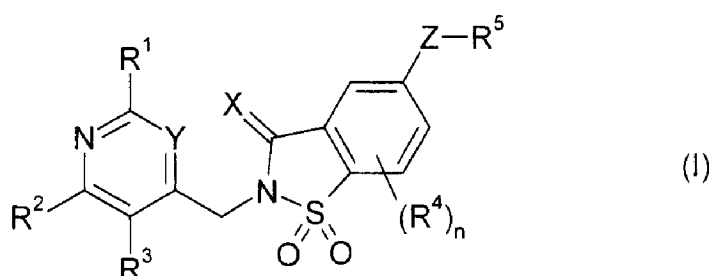
(54)名稱

磺醯胺化合物

SULFONAMIDE COMPOUNDS

(57)摘要

本發明係關於一種式(I)磺醯胺化合物：



其中 R^1 為 H、鹵素、CN、 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_4 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_2 - C_6 烯硫基、 C_2 - C_6 炔硫基、 C_1 - C_6 鹵烷基或 C_1 - C_6 鹵烷氧基； R^2 及 R^3 為 H、鹵素、CN、 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_4 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_2 - C_6 烯硫基、 C_2 - C_6 炔硫基、 C_1 - C_6 鹵烷基或 C_1 - C_6 鹵烷氧基；或 R^2 連同 R^3 一起形成稠合之 5 員或 6 員碳環或雜環； R^4 為鹵素、CN、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6

六、發明說明：

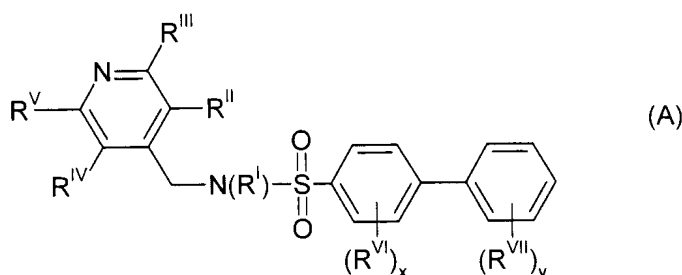
【發明所屬之技術領域】

本發明係關於適用於對抗有害動物之磺醯胺化合物以及製備彼等化合物之方法及該方法中所使用之前驅化合物。本發明進一步關於藉由使用該等化合物防治有害動物之方法，植物繁殖材料及包含該等化合物之農業及獸醫組合物。

【先前技術】

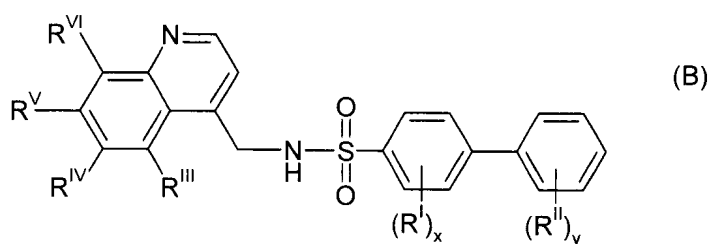
有害動物且特別諸如節肢動物及線蟲之無脊椎動物害蟲以及有害之齧齒動物破壞生長中及已收穫之作物且侵襲木製住宅及商用建築，造成食物供應及財產之巨大經濟損失。雖然已知多種殺有害生物劑，但因目標有害生物能夠對該等藥劑產生抗性，所以正需要對抗有害動物之新穎藥劑。因此，本發明之一目標為提供具有良好殺有害生物活性且展示對抗多種不同有害動物，尤其對抗難以防治之諸如昆蟲或蜘蛛類動物之節肢動物害蟲及線蟲以及有害之齧齒動物之廣譜活性的化合物。由於其特殊之飲食及社會習性，因此有效殺齧齒動物劑在致死濃度下應可口且具有延遲毒性效應。

WO 2006/097489描述式(A)之聯苯磺醯胺：



其中 R^I 為例如 H、烷基、烷氧基、烯基、炔基或苯甲基， R^{II} 至 R^V 為例如 H、鹵素、烷基、鹵甲基、烷氧基或鹵甲氧基， x 為 0、1、2、3 或 4， y 為 0、1、2、3、4 或 5，且 R^V 及 R^{VII} 為例如 H、鹵素、羥基、氰基、烷基、鹵烷基、烷氧基、鹵烷氧基等基團；及其防治植物病原性有害真菌及有害節肢動物之用途。

WO 2008/031824 描述式 (B) 之聯苯-4-基磺醯胺化合物：



其中 x 為 1 或 2， y 為 0、1、2、3、4 或 5， R^I 及 R^{II} 為例如鹵素、羥基、氰基、胺基、硝基、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、烷氧基、烯氧基、炔氧基、烷氧基烷氧基、環烷基烷氧基、 $C(OH)(CF_3)_2$ 、鹵烷基、鹵烯基、鹵烷氧基、鹵烯氧基、烷硫基、鹵烷硫基、烷基亞磺醯基、鹵烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、鹵烷基磺醯基等基團，且 R^{III} 至 R^{VI} 為例如氫、鹵素、羥基、氰基、胺基、硝基、烷基、烷氧基、鹵烷基、鹵烷氧基、烷硫基、鹵烷硫基、烷基亞磺醯基、鹵烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、鹵烷基磺醯基等基團，及其對抗節肢動物害蟲及線蟲之用途。

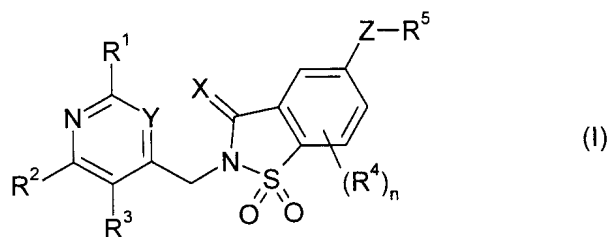
【發明內容】

本發明之一目標為提供具有良好殺有害生物活性、特別殺昆蟲活性且展示對抗多種不同有害動物、尤其對抗難以

防治之諸如昆蟲或蜘蛛類動物之節肢動物害蟲的廣譜活性的化合物。

本發明之另一目標為提供具有對抗齧齒動物及其他有害脊椎動物之良好殺有害生物活性的化合物。

已驚人地發現該等及其他目標可藉由式(I)磺醯胺化合物及其N-氧化物及鹽實現：



其中

R^1 係選自氫、鹵素、氰基、 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_4 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_2 - C_6 烯硫基、 C_2 - C_6 炔硫基、 C_1 - C_6 鹵烷基及 C_1 - C_6 鹵烷氧基；

R^2 及 R^3 係獨立地選自氫、鹵素、氰基、 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_4 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_2 - C_6 烯硫基、 C_2 - C_6 炔硫基、 C_1 - C_6 鹵烷基及 C_1 - C_6 鹵烷氧基；或

R^2 與 R^3 連同其所結合之碳原子一起形成稠合之5員或6員碳環或含有1或2個選自O、N及S之雜原子作為環成員之稠合之5員或6員雜環，其中各稠合之碳環或雜環未

經取代或具有1、2、3或4個彼此獨立地選自以下各基之取代基：鹵素、氰基、 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_4 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_2 - C_6 烯硫基、 C_2 - C_6 炔硫基、 C_1 - C_6 鹵烷基及 C_1 - C_6 鹵烷氧基；

R^4 係選自鹵素、氰基、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_6 烷基磺醯基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷硫基、 C_1 - C_6 鹵烷基亞磺醯基及 C_1 - C_6 鹵烷磺醯基；

n 為0、1、2或3，

R^5 係選自苯基及含有1、2或3個選自O、N及S之雜原子作為環成員之5員或6員雜環Het，其中苯基及Het未經取代或具有1、2、3或4個彼此獨立地選自以下各基之取代基：鹵素、氰基、 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_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_6 烷基磺醯基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷硫基、 C_1 - C_6 鹵烷基亞磺醯基及 C_1 - C_6 鹵烷基磺醯基；

X 為O或 NR^x ，其中 R^x 係選自氫、 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_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 烷基羰基及 C_1 - C_6 烷基羰氧基；

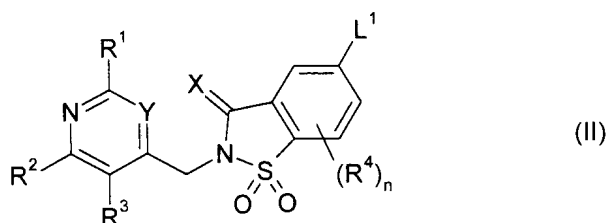
Y 為 N 或 C(R^y)，其中 R^y 係選自氫、鹵素、氰基、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₃-7環烷基-C₁-C₄烷基、C₁-C₆烷氧基、C₂-C₆烯氧基、C₂-C₆炔氧基、C₁-C₆烷硫基、C₂-C₆烯硫基、C₂-C₆炔硫基、C₁-C₆鹵烷基及 C₁-C₆鹵烷氧基；且

Z 為一化學鍵、O 或 N(R^z)，其中 R^z 係選自 C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₁-C₆烷氧基、C₂-C₆烯氧基、C₁-C₆烷基羰基及 C₁-C₆烷基羰氧基。

因此，本發明係關於式(I)之磺醯胺化合物及其 N-氧化物及鹽。

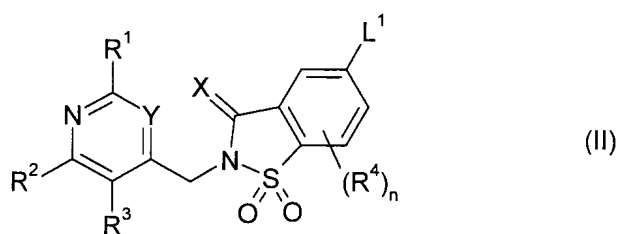
本發明之化合物(亦即式 I 化合物、其鹽、I 之 N-氧化物及 N-氧化物之鹽)具有對抗無脊椎動物害蟲、特別對抗節肢動物害蟲且尤其對抗昆蟲害蟲之良好殺有害生物活性，且展示對抗多種不同有害動物、尤其對抗難以防治之諸如昆蟲或蜘蛛類動物之節肢動物害蟲的廣譜活性。本發明之化合物亦展示對抗某些有害脊椎動物、特別對抗齧齒動物之延遲毒性效應，從而適合防治齧齒動物及其他有害脊椎動物。

本發明亦關於製備式(I)磺醯胺化合物之方法，該方法包含使式(II)化合物



與式 $R^5-(Z)-B(OR^{b1})(OR^{b2})$ 之酮酸衍生物在鹼及過渡金屬觸媒存在下反應以得到式 (I) 磺醯胺化合物，其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 X 、 Y 、 Z 及 n 如關於如技術方案 1 至 15 中任一項之式 (I) 化合物所定義且其中 L^1 為合適的離去基且 R^{b1} 及 R^{b2} 各自獨立地為氫或 C_1 - C_4 烷基，或 R^{b1} 與 R^{b2} 一起形成其中碳原子可未經取代或可全部或部分經甲基取代之 1,2-伸乙基部分。

式 (II) 磺醯胺化合物：



其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 n 、 X 及 Y 具有本文中針對式 (I) 化合物所定義之含義中之一種且其中 L^1 為鹵素，為製備本發明之式 (I) 磺醯胺化合物之新穎且適用的中間物。因此，本發明進一步關於如本文中所定義之式 (II) 化合物。

本發明進一步關於組合物，特別農業或獸醫組合物或誘餌組合物，其含有至少一種如本文中所定義之式 (I) 磺醯胺化合物、其 N-氧化物及/或其鹽及至少一種液體或固體載劑。

本發明進一步關於防治有害動物之方法，該方法包含用殺有害生物有效量之式 (I) 磺醯胺化合物或殺有害生物有效量之含有至少一種如本文中所定義之式 (I) 磺醯胺化合物之農業組合物處理害蟲、其食物源、其棲息地或其滋生地或

害蟲正生長或可生長於其中之植物、種子、土壤、區域、材料或環境，或欲保護以免遭害蟲侵襲或侵染之材料、植物、種子、土壤、表面或空間。

本發明之另一態樣係關於保護植物繁殖材料及/或由其生長之植物之方法，該方法包含用殺有害生物有效量之本發明之式(I)化合物或其農業上可接受之鹽或N-氧化物處理植物繁殖材料。

本發明之另一態樣係關於植物繁殖材料，其包含至少一種本發明之式(I)化合物及/或其農業上可接受之鹽或N-氧化物。

本發明進一步關於治療或保護例如哺乳動物、禽類或魚類之動物以免受寄生蟲侵染或感染之方法，該方法包含使動物與殺寄生蟲有效量之如本文中所定義之式(I)磺醯胺化合物或其獸醫學上可接受之鹽或N-氧化物接觸。使動物與本發明之式(I)化合物、其鹽或獸醫組合物接觸意謂將其施與或投與動物。

本發明進一步關於如本文中所定義之式(I)磺醯胺化合物或其獸醫學上可接受之鹽或N-氧化物防治有害動物的用途。

【實施方式】

連接於式(I)化合物之主鏈之基團可含有一或多個對掌性中心。在此狀況下，視取代基而定，式(I)化合物以不同對映異構物或非對映異構物形式存在。本發明係關於式(I)化合物之每一種可能的立體異構物，亦即單一對映異構物或

非對映異構物，以及其混合物。

本發明之化合物可呈非晶形或可呈具有不同宏觀性質(諸如穩定性)或展示不同生物性質(諸如活性)之一或多種不同結晶態(多晶型)存在。本發明包括式I之非晶形化合物與結晶化合物、個別化合物I之不同結晶態之混合物以及其非晶形鹽或結晶鹽。

如本文中所使用之術語「有害動物」涵蓋動物群體，特別指無脊椎動物害蟲群體，諸如昆蟲、蜘蛛類動物及線蟲。該等害蟲可侵襲植物，從而對所侵襲之植物造成實質性損害。如本文中所使用之術語「有害動物」涵蓋可侵染例如哺乳動物、禽類或魚類之動物，從而對所侵染之動物造成實質性損害之外寄生蟲。如本文中所使用之術語「有害動物」亦涵蓋可侵襲植物或植物繁殖材料，從而對所侵襲之植物造成實質性損害或可為疾病帶原者之齧齒動物之動物群體。

化合物(I)之農業上適用之鹽尤其涵蓋彼等其中陽離子及陰離子分別對化合物(I)之殺有害生物作用無不利效應之陽離子之鹽或酸之酸加成鹽。因此，合適的陽離子特別為鹼金屬離子，較佳為鈉及鉀離子；鹼土金屬離子，較佳為鈣、鎂及鋇離子；及過渡金屬離子，較佳為錳、銅、鋅及鐵離子；以及銨離子，必要時其可具有1至4個C₁-C₄烷基、羥基-C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基-C₁-C₄烷基或羥基-C₁-C₄烷氧基-C₁-C₄烷基取代基及/或1個苯基或苯甲基取代基，實例包括銨離子、甲基銨離子、異丙基銨離子、二異

丙基銨離子、四甲基銨離子、四乙基銨離子、四丁基銨離子、2-羥基乙基銨離子、2-(2-羥基乙氧基)乙-1-基銨離子(二乙二醇胺鹽)、二(2-羥基乙-1-基)銨離子(二醇胺鹽)、參(2-羥基乙-1-基)銨離子(三醇胺鹽)、參(3-丙醇)銨離子、三甲基苯甲基銨離子、三乙基苯甲基銨離子，此外包括磷離子、銻離子(較佳為三(C₁-C₄烷基)銻離子)及氧化銻離子(較佳為三(C₁-C₄烷基)氧化銻離子)。

適用之酸加成鹽之陰離子主要為氯離子、溴離子、氟離子、硫酸氫根、硫酸根、磷酸二氫根、磷酸氫根、磷酸根、硝酸根、碳酸氫根、碳酸根、六氟矽酸根、六氟磷酸根、苯甲酸根及C₁-C₄烷酸之陰離子，較佳為甲酸根、乙酸根、丙酸根及丁酸根。其可藉由使式(I)化合物與相應陰離子之酸(較佳為氫氯酸、氫溴酸、硫酸、磷酸或硝酸)反應來形成。

式(I)化合物之獸醫學上可接受之鹽尤其涵蓋此項技術中已知且已接受用於形成獸醫用途之鹽之彼等陽離子之鹽或酸加成鹽。合適的酸加成鹽(例如由含有例如胺基之鹼性氮原子之式(I)化合物所形成)包括無機酸之鹽，例如鹽酸鹽、硫酸鹽、磷酸鹽及硝酸鹽；及有機酸之鹽，例如乙酸鹽、順丁烯二酸鹽(例如順丁烯二酸之一元酸鹽或二元酸鹽)、二順丁烯二酸鹽、反丁烯二酸鹽(例如反丁烯二酸之一元酸鹽或二元酸鹽)、二反丁烯二酸鹽、甲烷次磺酸鹽、甲烷磺酸鹽及丁二酸鹽。

在以上所給出之變數定義中，使用對於所討論之取代基

具有一般代表性之集合術語。術語 C_x-C_y 指示在各種狀況下所討論之取代基或取代基部分中可能的碳原子數目。

如本文中所使用之術語「鹵素」係指氟、氯、溴及碘。

如本文中及在 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷基羰基、 C_1-C_6 烷基羧基、 C_1-C_6 烷基亞磺基、 C_1-C_6 烷基磺基、 C_1-C_6 烷基硫基之烷基部分中所使用之術語「 C_1-C_6 烷基」係指具有 1 至 6 個碳原子之直鏈或支鏈飽和烴基，例如甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基、1-乙基-2-甲基丙基及其類似基團。

相應地，如本文中所使用之「 C_1-C_6 烷氧基」及「 C_1-C_6 烷硫基」係指在烷基中之任何位置分別經由氧原子或硫原子鍵結之具有 1 至 6 個碳原子之直鏈或支鏈烷基(如上所提及)。實例包括甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、甲硫基、乙硫基、丙硫基、異丙硫基、正丁硫基及其類似基團。

相應地，「 C_1-C_6 烷基亞磺基」及「 C_1-C_6 烷基磺基」係指在烷基中之任何位置分別經由 $-S(=O)-$ 部分或 $-S(=O)_2-$

部分鍵結之具有1至6個碳原子之直鏈或支鏈烷基(如上所提及)。實例包括甲基亞磺醯基、甲基磺醯基及其類似基團。

相應地,「C₁-C₆烷基羰基」及「C₁-C₆烷基羰氧基」係指在烷基中之任何位置分別經由-C(=O)-部分或-C(=O)O-部分鍵結之具有1至6個碳原子之直鏈或支鏈烷基(如上所提及)。實例為乙醯基、乙醯氧基及其類似基團。

如本文中及在C₁-C₆鹵烷氧基、C₁-C₆鹵烷硫基、C₁-C₆鹵烷基亞磺醯基及C₁-C₆鹵烷基磺醯基之鹵烷基部分中所使用之術語「C₁-C₆鹵烷基」係指具有1至6個碳原子之直鏈或支鏈烷基(如上文所提及),其中該等基團中之一些或所有氫原子可經如上文所提及之鹵素原子置換,例如氯甲基、溴甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、1-氯乙基、1-溴乙基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基、2-氟丙基、3-氟丙基、2,2-二氟丙基、2,3-二氟丙基、2-氯丙基、3-氯丙基、2,3-二氯丙基、2-溴丙基、3-溴丙基、3,3,3-三氟丙基、3,3,3-三氯丙基、CH₂-C₂F₅、CF₂-C₂F₅、CF(CF₃)₂、1-(氟甲基)-2-氟乙基、1-(氯甲基)-2-氯乙基、1-(溴甲基)-2-溴乙基、4-氟丁基、4-氯丁基、4-溴丁基、九氟丁基、5-氟-1-戊基、5-氯-1-戊基、5-溴-1-戊基、5-碘-1-戊基、5,5,5-三氯-1-戊基、十一氟戊基、6-氟-1-己基、6-氯-1-己

基、6-溴-1-己基、6-碘-1-己基、6,6,6-三氯-1-己基、十二氯己基及其類似基團。

相應地，如本文中所使用之「C₁-C₆鹵烷氧基」及「C₁-C₆鹵烷硫基」係指在烷基中之任何位置分別經由氧原子或硫原子鍵結之具有1至6個碳原子之直鏈或支鏈鹵烷基(如上所提及)。實例包括氯甲氧基、溴甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、氯甲硫基、溴甲硫基、二氯甲硫基、三氯甲硫基、氟甲硫基、二氟甲硫基、三氟甲硫基、氯氟甲硫基、二氯氟甲硫基、氯二氟甲硫基及其類似基團。

相應地，「C₁-C₆鹵烷基亞磺醯基」及「C₁-C₆鹵烷基磺醯基」係指在烷基中之任何位置分別經由-S(=O)-部分或-S(=O)₂-部分鍵結之具有1至6個碳原子之直鏈或支鏈鹵烷基(如上所提及)。實例包括氯甲基亞磺醯基、溴甲基亞磺醯基、二氯甲基亞磺醯基、三氯甲基亞磺醯基、氟甲基亞磺醯基、二氟甲基亞磺醯基、三氟甲基亞磺醯基、氯氟甲基亞磺醯基、二氯氟甲基亞磺醯基、氯二氟甲基亞磺醯基、氯甲基磺醯基、溴甲基磺醯基、二氯甲基磺醯基、三氯甲基磺醯基、氟甲基磺醯基、二氟甲基磺醯基、三氟甲基磺醯基、氯氟甲基磺醯基、二氯氟甲基磺醯基、氯二氟甲基磺醯基及其類似基團。

如本文中及在C₂-C₆烯氧基及C₂-C₆烯硫基之烯基部分中所使用之術語「C₂-C₆烯基」係指具有2至6個碳原子且在

任何位置具有雙鍵之支鏈或非支鏈不飽和烴基，諸如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基-乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-1-丁烯基、2-甲基-1-丁烯基、3-甲基-1-丁烯基、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-1-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-1-戊烯基、2-甲基-1-戊烯基、3-甲基-1-戊烯基、4-甲基-1-戊烯基、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、1-甲基-3-戊烯基、2-甲基-3-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-1-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-1-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、1,3-二甲基-3-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-1-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、3,3-二甲基-1-丁烯基、3,3-二甲基-2-丁烯基、1-乙基-1-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-乙基-1-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、1-乙基-2-甲基-1-丙烯基、1-乙基-2-甲基-2-丙烯基及其類似基團。

相應地，如本文中所使用之「C₂-C₆烯氧基」及「C₂-C₆烯硫基」係指在烷基中之任何位置分別經由氧原子或硫原子鍵結之具有2至6個碳原子之直鏈或支鏈烯基(如以上所提及)。實例包括乙烯氧基、乙烯硫基及其類似基團。

如本文中及在C₂-C₆炔氧基及C₂-C₆炔硫基之炔基部分中所使用之術語「C₂-C₆炔基」係指具有2至6個碳原子且含有至少一個參鍵的支鏈或非支鏈不飽和烴基，諸如乙炔基、丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基及其類似基團。

相應地，如本文中所使用之「C₂-C₆炔氧基」及「C₂-C₆炔硫基」係指在烷基中之任何位置分別經由氧原子或硫原子鍵結之具有2至6個碳原子之直鏈或支鏈炔基(如上所提及)。實例包括乙炔氧基、乙炔硫基及其類似基團。

如本文中及在C₃-C₇環烷基-C₁-C₄烷基之環烷基部分中所使用之術語「C₃-C₇環烷基」係指3至7員飽和碳原子單環，諸如環丙基、環丁基、環戊基、環己基或環庚基。

如本文中所使用之術語「C₃-C₇環烷基-C₁-C₄烷基」係指具有1至4個碳原子之烷基(如上所提及)，其中烷基中之一個氫原子係經C₃-C₇環烷基置換。

如本文中所使用之術語「5員或6員雜環」係指具有5個或6個環成員且具有1、2、3或4個、較佳1、2或3個雜原子作為環成員之飽和或部分不飽和雜環基(「飽和或部分不飽和雜環」)，以及具有5個或6個環成員之單環雜芳族基

團，其可與5員、6員或7員碳環或雜環稠合，從而具有8至10之環成員總數，其中在各狀況下，1、2、3或4個，較佳1、2或3個該等環成員為彼此獨立地選自由O、N及S組成之群的雜原子(「雜芳基」)。雜環基可經由碳環成員或經由氮環成員與分子其餘部分連接。

飽和或部分不飽和雜環之實例包括吡咯啉基、吡唑啉基、咪唑啉基、吡咯啉基、吡唑啉基、咪唑啉基、四氫呋喃基、二氫呋喃基、1,3-二氧雜環戊基、間二氧雜環戊烯基、硫𪔐基、二氫噻吩基、噁唑啉基、異噁唑啉基、噁唑啉基、異噁唑啉基、噻唑啉基、異噻唑啉基、噻唑啉基、異噻唑啉基、氧硫雜環戊基、哌啉基、哌嗪基、哌喃基、二氫哌喃基、四氫哌喃基、1,3-二氧雜環己基及1,4-二氧雜環己基、硫哌喃基、二氫硫哌喃基、四氫硫哌喃基、嗎啉基、噻嗪基及其類似基團。

單環5至6員雜芳族基團之實例包括三嗪基、吡嗪基、嘧啶基、噻嗪基、吡啶基、噻吩基、呋喃基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、三唑基、四唑基、噻唑基、噁唑基、噻二唑基、噁二唑基、異噻唑基及異噁唑基。

如本文中所使用之術語「稠合之5員或6員碳環或雜環」係指如以上所定義之具有5個或6個環成員之部分不飽和或芳族碳環或雜環基團，其與與其稠合之環基團在環成員之間共有至少一個鍵，例如苯與吡啶之稠合為喹啉，苯與噻吩之稠合為喹噻啉，吡啶與吡啶之稠合為哌啶，呋喃與吡啶之稠合為呋喃并吡啶，二氫呋喃與吡啶之稠合為二氫呋喃并吡啶。

喃并吡啶，噻吩與吡啶之稠合為噻吩并吡啶且二氫噻吩與吡啶之稠合為二氫噻吩并吡啶。

如本文中所使用之術語「植物繁殖材料」包括可用於植物增殖之植物之所有生殖部分，諸如種子及諸如插條(cutting)及塊莖(例如馬鈴薯)之營養性植物材料。其包括種子、根、果實、塊莖、球莖、根莖、胚芽、萌芽及植物其他部分。亦可包括萌芽後或露土後移植之種子苗及秧苗。該等植物繁殖材料可在種植或移植時或種植或移植之前用植物保護化合物預防性處理。

術語「植物」包含任何類型之植物，包括「非栽培植物」且特別包括「栽培植物」。

術語「非栽培植物」係指栽培植物之任何野生型種或相關種或相關屬。

如本文中所使用之術語「栽培植物」包括已經育種、突變誘發或遺傳工程改造之植物。遺傳改造植物為在天然環境下不容易藉由雜交育種、突變或天然重組獲得、因此已藉由使用重組DNA技術改造其遺傳物質的植物。通常已將一或多個基因整合於遺傳改造植物之遺傳物質中以便改進植物之某些性質。該等遺傳改造亦包括(但不限於)例如藉由糖基化或聚合物加成(諸如異戊二烯化、乙醯化或法呢基化部分(farnesylated moiety)或PEG部分)對蛋白質(寡肽或多肽)進行靶向轉譯後修飾(例如如 Biotechnol Prog. 2001 年7-8月；17(4):720-8；Protein Eng Des Sel. 2004年1月；17(1):57-66；Nat. Protoc. 2007；2(5):1225-35；Curr. Opin.

Chem. Biol. 2006年10月；10(5):487-91；Epub 2006年8月28日；Biomaterials. 2001年3月；22(5):405-17；Bioconjug Chem. 2005年1-2月；16(1):113-21)。

如本文中所使用之術語「栽培植物」進一步包括因習知育種或遺傳工程改造方法所致之對特定類別之除草劑之施用具有耐受性之植物，該等除草劑諸如羥基-苯基丙酮酸二加氧酶(HPPD)抑制劑；乙醯乳酸合成酶(ALS)抑制劑，諸如磺酰脲(例如參見US 6,222,100、WO 01/82685、WO 00/26390、WO 97/41218、WO 98/02526、WO 98/02527、WO 04/106529、WO 05/20673、WO 03/14357、WO 03/13225、WO 03/14356、WO 04/16073)或咪唑啉酮(imidazolinone)(例如參見US 6,222,100、WO 01/82685、WO 00/26390、WO 97/41218、WO 98/02526、WO 98/02527、WO 04/106529、WO 05/20673、WO 03/14357、WO 03/13225、WO 03/14356、WO 04/16073)；烯醇丙酮醯莽草酸-3-磷酸酯合成酶(EPSPS)抑制劑，諸如草甘膦(glyphosate)(例如參見WO 92/00377)；麩胺醯胺合成酶(GS)抑制劑，諸如草胺膦(glufosinate)(例如參見EP-A-0242236、EP-A-242246)或二甲甲腈除草劑(oxynil herbicide)(例如參見US 5,559,024)。多種栽培植物已因習知育種(突變誘發)方法而對除草劑具有耐受性，例如 Clearfield[®]夏季油菜(Canola)對咪唑啉酮(例如甲氧咪草煙(imazamox))具有耐受性。遺傳工程改造法已用於使諸如大豆、棉花、玉米、甜菜及油菜之栽培植物變得對除草劑具有耐受性，除草劑諸如草甘膦及草胺

膦，其中一些可以商標名稱 RoundupReady[®](草甘膦)及 LibertyLink[®](草銨膦)自市面上購得。

如本文中所使用之術語「栽培植物」進一步包括藉由使用重組DNA技術能夠合成一或多種以下物質之植物：殺昆蟲蛋白質，尤其已知獲自細菌屬芽孢桿菌、尤其蘇雲金桿菌(*Bacillus thuringiensis*)之蛋白質，諸如 α -內毒素，例如 CryIA(b)、CryIA(c)、CryIF、CryIF(a2)、CryIIA(b)、CryIIIA、CryIIIB(b1)或 Cry9c；營養性殺昆蟲蛋白質(VIP)，例如 VIP1、VIP2、VIP3或VIP3A；細菌拓殖線蟲之殺昆蟲蛋白質，例如發光桿菌屬(*Photobacterium* spp.)或異桿菌屬(*Xenorhabdus* spp.)；由動物產生之毒素，諸如蠍毒素、蜘蛛類動物毒素、黃蜂毒素或其他昆蟲特異性神經毒素；由真菌產生之毒素，諸如鏈黴菌毒素；植物凝集素，諸如豌豆或大麥凝集素；凝集素；蛋白酶抑制劑，諸如胰蛋白酶抑制劑，絲胺酸蛋白酶抑制劑、馬鈴薯塊莖儲藏蛋白(patatin)、半胱胺酸蛋白酶或木瓜蛋白酶抑制劑；核糖體失活蛋白質(RIP)，諸如蓖麻毒素、玉蜀黍RIP、相思子素(abrin)、絲瓜籽毒素(luffin)、皂素或異株腹瀉毒蛋白(bryodin)；類固醇代謝酶，諸如3-羥基類固醇氧化酶、蛻皮類固醇-IDP-糖基-轉移酶、膽固醇氧化酶、蛻皮激素抑制劑或HMG-CoA還原酶；離子通道阻斷劑，諸如鈉或鈣通道阻斷劑；保幼激素酯酶；利尿激素受體(異株瀉根毒蛋白受體(helicokinin receptor))；芪合成酶，聯苳合成酶、甲殼素酶或葡聚糖酶。在本發明之上下文中，該等殺

昆蟲蛋白質或毒素亦應明確理解為原毒素、雜交蛋白、經截短或經修飾蛋白質。雜交蛋白之特徵為蛋白質域之新穎組合(例如參見WO 02/015701)。該等毒素或能夠合成該等毒素之遺傳改造植物之其他實例揭示於(例如)EP-A 374 753、WO 93/007278、WO 95/34656、EP-A 427 529、EP-A 451 878、WO 03/018810及WO 03/052073。產生該等遺傳改造植物之方法通常為熟習此項技術者所知且描述於(例如)以上所提及之公開案中。遺傳改造植物中所含之該等殺昆蟲蛋白質保護產生該等蛋白質之植物以免遭來自節肢動物昆蟲之某些分類群之有害害蟲，尤其甲蟲類(鞘翅目)、蒼蠅類(雙翅目)及蝴蝶類及蛾類(鱗翅目)及植物寄生線蟲類(線蟲綱)。

如本文中所使用之術語「栽培植物」進一步包括藉由使用重組DNA技術能夠合成一或多種蛋白質以增加植物對細菌、病毒或真菌病原體之抗性或耐受性的植物。該等蛋白質之實例為所謂的「致病性相關蛋白質」(PR蛋白質，例如參見EP-A 0 392 225)、植物疾病抗性基因(例如馬鈴薯栽培品種，其表現對源自墨西哥野生馬鈴薯 (*Solanum bulbocastanum*)之致病疫黴(*Phytophthora infestans*)具有抵抗作用的抗性基因)或T4-溶菌酶(例如能夠合成對細菌(諸如梨火疫病原細菌(*Erwinia amylovora*))具有增強之抗性之該等蛋白質的馬鈴薯栽培品種)。產生該等遺傳改造植物之方法通常為熟習此項技術者所知且描述於(例如)以上所提及之公開案中。

如本文中所使用之術語「栽培植物」進一步包括藉由使用重組DNA技術能夠合成一或多種增加彼等植物之生產力(例如, 生物質量產量、穀粒產量、澱粉含量、油含量或蛋白質含量)、對乾旱、鹽度或其他生長限制性環境因素之耐受性或對害蟲及真菌、細菌或病毒病原體之耐受性之蛋白質的植物。

如本文中所使用之術語「栽培植物」進一步包括藉由使用重組DNA技術而含有尤其可改進人類或動物營養之改良量之物質或新物質的植物, 例如產生有利於健康之長鏈 ω -3脂肪酸或不飽和 ω -9脂肪酸之油作物(例如Nexera[®]油菜)。

如本文中所使用之術語「栽培植物」進一步包括藉由使用重組DNA技術而含有尤其可改進原料生產之改良量之物質或新物質的植物, 例如產生增加量之支鏈澱粉之馬鈴薯(例如Amflora[®]馬鈴薯)。

下文關於式(I)化合物之變數、本發明之用途及方法及本發明之組合物之特徵之較佳實施例所作之說明單獨為有效的且較佳彼此組合。

較佳為式(I)磺醯胺化合物, 其中 R^1 係選自氫、鹵素、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 鹵烷基及 C_1 - C_6 鹵烷氧基。 R^1 更佳係選自氫、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷基及 C_1 - C_4 鹵烷氧基。特定而言, R^1 為氫、甲氧基或甲基, 尤其為氫或甲基。

進一步較佳為式(I)磺醯胺化合物, 其中 R^2 及 R^3 係獨立地選自氫、鹵素、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、

C₁-C₆烷硫基、C₁-C₆鹵烷基及C₁-C₆鹵烷氧基。R²及R³更佳獨立地選自氫、C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷基及C₁-C₄鹵烷氧基。特定而言，R²及R³為氫或甲基，尤其為氫。

同樣較佳為式(I)磺醯胺化合物，其中R²與R³連同其所結合之碳原子一起形成稠合之5員或6員碳環或含有1個選自O、N及S之雜原子作為環成員之稠合之5員或6員雜環，其中各稠合之碳環或雜環未經取代或具有1個或2個彼此獨立地選自以下各基之取代基：鹵素、氰基、C₁-C₆烷基、C₃-C₇環烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆烷硫基、C₁-C₆鹵烷基及C₁-C₆鹵烷氧基。更佳地，在此狀況下，R²與R³連同其所結合之碳原子一起形成稠合之二氫呋喃、呋喃、二氫噻吩、噻吩、苯或吡啶，其中各稠合環未經取代或具有1個或2個彼此獨立地選自C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷基及C₁-C₄鹵烷氧基之取代基。特定而言，R²與R³連同其所結合之碳原子一起形成稠合苯，其未經取代或具有1個或2個彼此獨立地選自C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷基及C₁-C₄鹵烷氧基、尤其選自甲基或甲氧基之取代基。

進一步較佳為式(I)磺醯胺化合物，其中Y為C(R^y)且R^y係選自氫、鹵素、C₁-C₆烷基、C₃-C₇環烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆烷硫基、C₁-C₆鹵烷基及C₁-C₆鹵烷氧基。在該實施例中，R^y較佳選自氫、C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷基及C₁-C₄鹵烷氧基。R^y特別為氫。

其中Y為N之式(I)磺醯胺化合物亦較佳。

其中X為O或NH之式(I)磺醯胺化合物進一步較佳。X特別為O。

若n不為0，則其中R⁴選自鹵素、C₁-C₄烷基及C₁-C₄鹵烷基之式(I)磺醯胺化合物進一步較佳。

其中n為0或1之式(I)磺醯胺化合物同樣較佳。n更佳為0。

其中Z為一化學鍵或O之式(I)磺醯胺化合物進一步較佳。Z特別為一化學鍵。

本發明之一較佳實施例係關於式(I)磺醯胺化合物，其中R⁵係選自未經取代或具有1個或2個如以上所定義且較佳彼此獨立地選自以下各基之取代基的苯基：鹵素、C₁-C₄烷基、C₃-C₇環烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄烷基亞磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基、C₁-C₄鹵烷基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄鹵烷硫基、C₁-C₄鹵烷基亞磺醯基及C₁-C₄鹵烷基磺醯基。R⁵更佳為未經取代或具有1個或2個彼此獨立地選自以下各基之取代基的苯基：鹵素、C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄烷基磺醯基、C₁-C₄鹵烷基、C₁-C₄鹵烷氧基及C₁-C₄鹵烷硫基。R⁵特別為未經取代或具有1個或2個彼此獨立地選自以下各基之取代基的苯基：F、Cl、CN、CH₃、C₂H₅、CH(CH₃)₂、CF₃、OCH₃、OC₂H₅、OCHF₂、SCH₃、SCF₃及SO₂CH₃。

若R⁵為具有1個取代基之苯基，則該取代基相對於鍵結位置較佳連接在2-位置或4-位置。若R⁵為具有2個取代基之

苯基，則該等取代基相對於鍵結位置較佳連接在2-位置及4-位置或連接在2-位置及5-位置。

尤其較佳為式(I)磺醯胺化合物，其中R⁵為未經取代或具有1個或2個如以上所定義之取代基之苯基且其中Z為一化學鍵。

本發明之另一較佳實施例係關於式(I)磺醯胺化合物，其中R⁵係選自含有1、2或3個選自O、N及S之雜原子作為環成員之5員或6員雜環Het，其中Het未經取代或具有1個或2個如以上所定義之取代基且其中該等取代基較佳彼此獨立地選自鹵素、C₁-C₄烷基、C₃-C₇環烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄烷基亞磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基、C₁-C₄鹵烷基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄鹵烷硫基、C₁-C₄鹵烷基亞磺醯基及C₁-C₄鹵烷基磺醯基。

Het較佳選自呋喃基(furanyl/furyl)、吡咯基、噻吩基(thiophenyl/thienyl)、噁唑基、異噁唑基、吡唑基、咪唑基、噻唑基、異噻唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,2,3-三唑基、1,2,4-三唑基、吡啶基、吡嗪基、嘧啶基及噻嗪基，其中前述基團之每一者未經取代或具有1個或2個如以上所定義之取代基，且其中該等取代基較佳彼此獨立地選自鹵素、C₁-C₄烷基、C₃-C₇環烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄烷基亞磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基、C₁-C₄鹵烷基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄鹵烷硫基、C₁-C₄鹵烷基亞磺醯基及C₁-C₄鹵烷基磺醯基。Het更佳選自異噁唑-3-基、異噻唑-

3-基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-3-基、吡啶-2-基及吡啶-3-基，其中前述基團之每一者未經取代或具有1個或2個彼此獨立地選自以下各基之取代基：鹵素、 C_1 - C_4 烷基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺基、 C_1 - C_4 烷基磺基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷基亞磺基及 C_1 - C_4 鹵烷基磺基。Het最佳選自吡啶-2-基，其未經取代或在吡啶環之3-位置及/或5-位置具有1個或2個前述取代基。

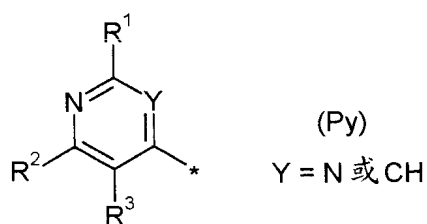
特定而言，Het未經取代或具有1個或2個彼此獨立地選自以下各基之取代基：F、Cl、CN、 CH_3 、 C_2H_5 、 $CH(CH_3)_2$ 、 CF_3 、 OCH_3 、 OC_2H_5 、 $OCHF_2$ 、 SCH_3 、 SCF_3 及 SO_2CH_3 。

其中 R^5 為如以上所定義之Het且其中Z為O之式(I)磺醯胺化合物進一步特別較佳。

因此，本發明之一特別較佳實施例係關於式(I)磺醯胺化合物，其中 R^5 係選自吡啶-2-基且Z為O，其中吡啶未經取代或具有1個或2個較佳位於吡啶環之3-位置及/或5-位置之如以上所定義之取代基，且其中該等取代基係如以上所定義且較佳彼此獨立地選自鹵素、 C_1 - C_4 烷基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺基、 C_1 - C_4 烷基磺基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷基亞磺基及 C_1 - C_4 鹵烷基磺基，且尤其彼此獨立地選自F、Cl、CN、 CH_3 、 C_2H_5 、 $CH(CH_3)_2$ 、 CF_3 、 OCH_3 、 OC_2H_5 、 $OCHF_2$ 、 SCH_3 、 SCF_3 及

SO₂CH₃。

合適吡啶或嘧啶部分(Py)之實例



列於下表A中。在式(Py)中，*表示與式(I)磺醯胺化合物之其餘部分之鍵結位點。

表 A

(Py)	R ¹	R ²	R ³
1	H	H	H
2	Cl	H	H
3	CH ₃	H	H
4	C ₂ H ₅	H	H
5	CH(CH ₃) ₂	H	H
6	環丙基	H	H
7	CF ₃	H	H
8	OCH ₃	H	H
9	OCHF ₂	H	H
10	SCH ₃	H	H
11	H	Cl	H
12	Cl	Cl	H
13	CH ₃	Cl	H
14	C ₂ H ₅	Cl	H
15	CH(CH ₃) ₂	Cl	H
16	環丙基	Cl	H
17	CF ₃	Cl	H
18	OCH ₃	Cl	H
19	OCHF ₂	Cl	H
20	SCH ₃	Cl	H
21	H	CH ₃	H
22	Cl	CH ₃	H
23	CH ₃	CH ₃	H
24	C ₂ H ₅	CH ₃	H
25	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H
26	環丙基	CH ₃	H
27	CF ₃	CH ₃	H
28	OCH ₃	CH ₃	H
29	OCHF ₂	CH ₃	H
30	SCH ₃	CH ₃	H
31	H	C ₂ H ₅	H
32	Cl	C ₂ H ₅	H

(Py)	R ¹	R ²	R ³
33	CH ₃	C ₂ H ₅	H
34	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
35	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	H
36	環丙基	C ₂ H ₅	H
37	CF ₃	C ₂ H ₅	H
38	OCH ₃	C ₂ H ₅	H
39	OCHF ₂	C ₂ H ₅	H
40	SCH ₃	C ₂ H ₅	H
41	H	CH(CH ₃) ₂	H
42	Cl	CH(CH ₃) ₂	H
43	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H
44	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂	H
45	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H
46	環丙基	CH(CH ₃) ₂	H
47	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H
48	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂	H
49	OCHF ₂	CH(CH ₃) ₂	H
50	SCH ₃	CH(CH ₃) ₂	H
51	H	環丙基	H
52	Cl	環丙基	H
53	CH ₃	環丙基	H
54	C ₂ H ₅	環丙基	H
55	CH(CH ₃) ₂	環丙基	H
56	環丙基	環丙基	H
57	CF ₃	環丙基	H
58	OCH ₃	環丙基	H
59	OCHF ₂	環丙基	H
60	SCH ₃	環丙基	H
61	H	CF ₃	H
62	Cl	CF ₃	H
63	CH ₃	CF ₃	H

(Py)	R ¹	R ²	R ³
64	C ₂ H ₅	CF ₃	H
65	CH(CH ₃) ₂	CF ₃	H
66	環丙基	CF ₃	H
67	CF ₃	CF ₃	H
68	OCH ₃	CF ₃	H
69	OCHF ₂	CF ₃	H
70	SCH ₃	CF ₃	H
71	H	OCH ₃	H
72	Cl	OCH ₃	H
73	CH ₃	OCH ₃	H
74	C ₂ H ₅	OCH ₃	H
75	CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	H
76	環丙基	OCH ₃	H
77	CF ₃	OCH ₃	H
78	OCH ₃	OCH ₃	H
79	OCHF ₂	OCH ₃	H
80	SCH ₃	OCH ₃	H
81	H	OCHF ₂	H
82	Cl	OCHF ₂	H
83	CH ₃	OCHF ₂	H
84	C ₂ H ₅	OCHF ₂	H
85	CH(CH ₃) ₂	OCHF ₂	H
86	環丙基	OCHF ₂	H
87	CF ₃	OCHF ₂	H
88	OCH ₃	OCHF ₂	H
89	OCHF ₂	OCHF ₂	H
90	SCH ₃	OCHF ₂	H
91	H	SCH ₃	H
92	Cl	SCH ₃	H
93	CH ₃	SCH ₃	H
94	C ₂ H ₅	SCH ₃	H
95	CH(CH ₃) ₂	SCH ₃	H
96	環丙基	SCH ₃	H
97	CF ₃	SCH ₃	H
98	OCH ₃	SCH ₃	H
99	OCHF ₂	SCH ₃	H
100	SCH ₃	SCH ₃	H
101	H	H	Cl
102	Cl	H	Cl
103	CH ₃	H	Cl
104	C ₂ H ₅	H	Cl
105	CH(CH ₃) ₂	H	Cl
106	環丙基	H	Cl
107	CF ₃	H	Cl
108	OCH ₃	H	Cl
109	OCHF ₂	H	Cl
110	SCH ₃	H	Cl
111	H	H	CH ₃
112	Cl	H	CH ₃
113	CH ₃	H	CH ₃
114	C ₂ H ₅	H	CH ₃
115	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃

(Py)	R ¹	R ²	R ³
116	環丙基	H	CH ₃
117	CF ₃	H	CH ₃
118	OCH ₃	H	CH ₃
119	OCHF ₂	H	CH ₃
120	SCH ₃	H	CH ₃
121	H	H	C ₂ H ₅
122	Cl	H	C ₂ H ₅
123	CH ₃	H	C ₂ H ₅
124	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅
125	CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅
126	環丙基	H	C ₂ H ₅
127	CF ₃	H	C ₂ H ₅
128	OCH ₃	H	C ₂ H ₅
129	OCHF ₂	H	C ₂ H ₅
130	SCH ₃	H	C ₂ H ₅
131	H	H	CH(CH ₃) ₂
132	Cl	H	CH(CH ₃) ₂
133	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
134	C ₂ H ₅	H	CH(CH ₃) ₂
135	CH(CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃) ₂
136	環丙基	H	CH(CH ₃) ₂
137	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂
138	OCH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
139	OCHF ₂	H	CH(CH ₃) ₂
140	SCH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
141	H	H	環丙基
142	Cl	H	環丙基
143	CH ₃	H	環丙基
144	C ₂ H ₅	H	環丙基
145	CH(CH ₃) ₂	H	環丙基
146	環丙基	H	環丙基
147	CF ₃	H	環丙基
148	OCH ₃	H	環丙基
149	OCHF ₂	H	環丙基
150	SCH ₃	H	環丙基
151	H	H	CF ₃
152	Cl	H	CF ₃
153	CH ₃	H	CF ₃
154	C ₂ H ₅	H	CF ₃
155	CH(CH ₃) ₂	H	CF ₃
156	環丙基	H	CF ₃
157	CF ₃	H	CF ₃
158	OCH ₃	H	CF ₃
159	OCHF ₂	H	CF ₃
160	SCH ₃	H	CF ₃
161	H	H	OCH ₃
162	Cl	H	OCH ₃
163	CH ₃	H	OCH ₃
164	C ₂ H ₅	H	OCH ₃
165	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃
166	環丙基	H	OCH ₃

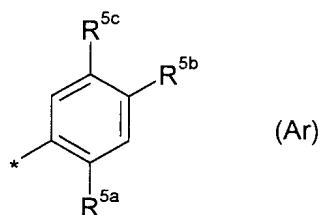
(Py)	R ¹	R ²	R ³
167	CF ₃	H	OCH ₃
168	OCH ₃	H	OCH ₃
169	OCHF ₂	H	OCH ₃
170	SCH ₃	H	OCH ₃
171	H	H	OCHF ₂
172	Cl	H	OCHF ₂
173	CH ₃	H	OCHF ₂
174	C ₂ H ₅	H	OCHF ₂
175	CH(CH ₃) ₂	H	OCHF ₂
176	環丙基	H	OCHF ₂
177	CF ₃	H	OCHF ₂
178	OCH ₃	H	OCHF ₂
179	OCHF ₂	H	OCHF ₂
180	SCH ₃	H	OCHF ₂
181	H	H	SCH ₃
182	Cl	H	SCH ₃
183	CH ₃	H	SCH ₃
184	C ₂ H ₅	H	SCH ₃
185	CH(CH ₃) ₂	H	SCH ₃
186	環丙基	H	SCH ₃
187	CF ₃	H	SCH ₃
188	OCH ₃	H	SCH ₃
189	OCHF ₂	H	SCH ₃
190	SCH ₃	H	SCH ₃
191	H	Cl	Cl
192	H	CH ₃	Cl
193	H	C ₂ H ₅	Cl
194	H	CH(CH ₃) ₂	Cl
195	H	環丙基	Cl
196	H	CF ₃	Cl
197	H	OCH ₃	Cl
198	H	OCHF ₂	Cl
199	H	SCH ₃	Cl
200	H	Cl	CH ₃
201	H	CH ₃	CH ₃
202	H	C ₂ H ₅	CH ₃
203	H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
204	H	環丙基	CH ₃
205	H	CF ₃	CH ₃
206	H	OCH ₃	CH ₃
207	H	OCHF ₂	CH ₃
208	H	SCH ₃	CH ₃
209	H	Cl	C ₂ H ₅
210	H	CH ₃	C ₂ H ₅
211	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
212	H	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅
213	H	環丙基	C ₂ H ₅
214	H	CF ₃	C ₂ H ₅
215	H	OCH ₃	C ₂ H ₅
216	H	OCHF ₂	C ₂ H ₅
217	H	SCH ₃	C ₂ H ₅
218	H	Cl	CH(CH ₃) ₂

(Py)	R ¹	R ²	R ³
219	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
220	H	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂
221	H	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂
222	H	環丙基	CH(CH ₃) ₂
223	H	CF ₃	CH(CH ₃) ₂
224	H	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂
225	H	OCHF ₂	CH(CH ₃) ₂
226	H	SCH ₃	CH(CH ₃) ₂
227	H	Cl	環丙基
228	H	CH ₃	環丙基
229	H	C ₂ H ₅	環丙基
230	H	CH(CH ₃) ₂	環丙基
231	H	環丙基	環丙基
232	H	CF ₃	環丙基
233	H	OCH ₃	環丙基
234	H	OCHF ₂	環丙基
235	H	SCH ₃	環丙基
236	H	Cl	CF ₃
237	H	CH ₃	CF ₃
238	H	C ₂ H ₅	CF ₃
239	H	CH(CH ₃) ₂	CF ₃
240	H	環丙基	CF ₃
241	H	CF ₃	CF ₃
242	H	OCH ₃	CF ₃
243	H	OCHF ₂	CF ₃
244	H	SCH ₃	CF ₃
245	H	Cl	OCH ₃
246	H	CH ₃	OCH ₃
247	H	C ₂ H ₅	OCH ₃
248	H	CH(CH ₃) ₂	OCH ₃
249	H	環丙基	OCH ₃
250	H	CF ₃	OCH ₃
251	H	CF ₃	OCH ₃
252	H	OCH ₃	OCH ₃
253	H	OCHF ₂	OCH ₃
254	H	SCH ₃	OCH ₃
255	H	Cl	OCHF ₂
256	H	CH ₃	OCHF ₂
257	H	C ₂ H ₅	OCHF ₂
258	H	CH(CH ₃) ₂	OCHF ₂
259	H	環丙基	OCHF ₂
260	H	CF ₃	OCHF ₂
261	H	OCH ₃	OCHF ₂
262	H	OCHF ₂	OCHF ₂
263	H	SCH ₃	OCHF ₂
264	H	Cl	SCH ₃
265	H	CH ₃	SCH ₃
266	H	C ₂ H ₅	SCH ₃
267	H	CH(CH ₃) ₂	SCH ₃
268	H	環丙基	SCH ₃
269	H	CF ₃	SCH ₃

(Py)	R ¹	R ²	R ³
270	H	OCH ₃	SCH ₃
271	H	OCHF ₂	SCH ₃
272	H	SCH ₃	SCH ₃
273	H	-CH=CH-CH=CH-	
274	H	-CH=CH-CH=N-	
275	H	-O-CH ₂ -CH ₂ -	
276	H	-O-CH=CH-	

(Py)	R ¹	R ²	R ³
277	H	-S-CH ₂ -CH ₂ -	
278	H	-S-	
279	H	-CH ₂ -CH ₂ -O	
280	H	-CH=CH-O-	
281	H	-CH ₂ -CH ₂ -S-	
282	H	-CH=CH-S-	

合適基團 R⁵ 之實例為式 (Ar) 基團：



其中 R^{5a}、R^{5b} 及 R^{5c} 具有下表 B 中所列之含義。在式 (Ar) 中，* 表示與式 (I) 磺醯胺化合物之其餘部分之鍵結位點。

表 B

Ar	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{5c}
1	H	H	H
2	F	H	H
3	Cl	H	H
4	CH ₃	H	H
5	CF ₃	H	H
6	H	F	H
7	H	Cl	H
8	H	CN	H
9	H	CH ₃	H
10	H	C ₂ H ₅	H
11	H	CH(CH ₃) ₂	H
12	H	CF ₃	H
13	H	OCH ₃	H
14	H	OC ₂ H ₅	H
15	H	OCHF ₂	H
16	H	SCH ₃	H
17	H	SCF ₃	H
18	H	SO ₂ CH ₃	H
19	F	F	H
20	F	Cl	H
21	F	CN	H
22	F	CH ₃	H
23	F	C ₂ H ₅	H
24	F	CH(CH ₃) ₂	H

Ar	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{5c}
25	F	CF ₃	H
26	F	OCH ₃	H
27	F	OC ₂ H ₅	H
28	F	OCHF ₂	H
29	F	SCH ₃	H
30	F	SCF ₃	H
31	F	SO ₂ CH ₃	H
32	Cl	F	H
33	Cl	Cl	H
34	Cl	CN	H
35	Cl	CH ₃	H
36	Cl	C ₂ H ₅	H
37	Cl	CH(CH ₃) ₂	H
38	Cl	CF ₃	H
39	Cl	OCH ₃	H
40	Cl	OC ₂ H ₅	H
41	Cl	OCHF ₂	H
42	Cl	SCH ₃	H
43	Cl	SCF ₃	H
44	Cl	SO ₂ CH ₃	H
45	CH ₃	F	H
46	CH ₃	Cl	H
47	CH ₃	CN	H
48	CH ₃	CH ₃	H

Ar	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{5c}
49	CH ₃	C ₂ H ₅	H
50	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H
51	CH ₃	CF ₃	H
52	CH ₃	OCH ₃	H
53	CH ₃	OC ₂ H ₅	H
54	CH ₃	OCHF ₂	H
55	CH ₃	SCH ₃	H
56	CH ₃	SCF ₃	H
57	CH ₃	SO ₂ CH ₃	H
58	CF ₃	F	H
59	CF ₃	Cl	H
60	CF ₃	CN	H
61	CF ₃	CH ₃	H
62	CF ₃	C ₂ H ₅	H
63	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H
64	CF ₃	CF ₃	H
65	CF ₃	OCH ₃	H
66	CF ₃	OC ₂ H ₅	H
67	CF ₃	OCHF ₂	H
68	CF ₃	SCH ₃	H
69	CF ₃	SCF ₃	H
70	CF ₃	SO ₂ CH ₃	H
71	F	H	F
72	F	H	Cl
73	F	H	CN
74	F	H	CH ₃
75	F	H	C ₂ H ₅
76	F	H	CH(CH ₃) ₂
77	F	H	CF ₃
78	F	H	OCH ₃
79	F	H	OC ₂ H ₅
80	F	H	OCHF ₂
81	F	H	SCH ₃
82	F	H	SCF ₃
83	F	H	SO ₂ CH ₃
84	Cl	H	F
85	Cl	H	Cl
86	Cl	H	CN

Ar	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{5c}
87	Cl	H	CH ₃
88	Cl	H	C ₂ H ₅
89	Cl	H	CH(CH ₃) ₂
90	Cl	H	CF ₃
91	Cl	H	OCH ₃
92	Cl	H	OC ₂ H ₅
93	Cl	H	OCHF ₂
94	Cl	H	SCH ₃
95	Cl	H	SCF ₃
96	Cl	H	SO ₂ CH ₃
97	CH ₃	H	F
98	CH ₃	H	Cl
99	CH ₃	H	CN
100	CH ₃	H	CH ₃
101	CH ₃	H	C ₂ H ₅
102	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
103	CH ₃	H	CF ₃
104	CH ₃	H	OCH ₃
105	CH ₃	H	OC ₂ H ₅
106	CH ₃	H	OCHF ₂
107	CH ₃	H	SCH ₃
108	CH ₃	H	SCF ₃
109	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃
110	CF ₃	H	F
111	CF ₃	H	Cl
112	CF ₃	H	CN
113	CF ₃	H	CH ₃
114	CF ₃	H	C ₂ H ₅
115	CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂
116	CF ₃	H	CF ₃
117	CF ₃	H	OCH ₃
118	CF ₃	H	OC ₂ H ₅
119	CF ₃	H	OCHF ₂
120	CF ₃	H	SCH ₃
121	CF ₃	H	SCF ₃
122	CF ₃	H	SO ₂ CH ₃

合適基團 R⁵ 之其他實例為下表 C 中所列之基團 Het。

表 C

Het	R ⁵
1	吡啶-2-基
2	3-氟吡啶-2-基
3	3-氯吡啶-2-基
4	3-氟基吡啶-2-基

Het	R ⁵
5	3-甲基吡啶-2-基
6	3-乙基吡啶-2-基
7	3-異丙基吡啶-2-基
8	3-三氟甲基吡啶-2-基

Het	R ⁵
9	3-甲氧基吡啶-2-基
10	3-乙氧基吡啶-2-基
11	3-二氟甲氧基吡啶-2-基
12	3-甲基硫基吡啶-2-基
13	3-三氟甲基硫基吡啶-2-基
14	3-甲基磺基吡啶-2-基
15	5-氟吡啶-2-基
16	5-氯吡啶-2-基
17	5-氟基吡啶-2-基
18	5-甲基吡啶-2-基
19	5-乙基吡啶-2-基
20	5-異丙基吡啶-2-基
21	5-三氟甲基吡啶-2-基
22	5-甲氧基吡啶-2-基
23	5-乙氧基吡啶-2-基
24	5-二氟甲氧基吡啶-2-基
25	5-甲基硫基吡啶-2-基
26	5-三氟甲基硫基吡啶-2-基
27	5-甲基磺基吡啶-2-基
28	3,5-二氟吡啶-2-基
29	3-氟-5-氯吡啶-2-基
30	3-氟-5-氟基吡啶-2-基
31	3-氟-5-甲基吡啶-2-基
32	3-氟-5-乙基吡啶-2-基
33	3-氟-5-異丙基吡啶-2-基
34	3-氟-5-三氟甲基吡啶-2-基
35	3-氟-5-甲氧基吡啶-2-基
36	3-氟-5-乙氧基吡啶-2-基
37	3-氟-5-二氟甲氧基吡啶-2-基
38	3-氟-5-甲基硫基吡啶-2-基
39	3-氟-5-三氟甲基硫基吡啶-2-基
40	3-氟-5-甲基磺基吡啶-2-基
41	3-氯-5-氟吡啶-2-基
42	3,5-二氯吡啶-2-基
43	3-氯-5-氟基吡啶-2-基
44	3-氯-5-甲基吡啶-2-基
45	3-氯-5-乙基吡啶-2-基
46	3-氯-5-異丙基吡啶-2-基
47	3-氯-5-三氟甲基吡啶-2-基
48	3-氯-5-甲氧基吡啶-2-基
49	3-氯-5-乙氧基吡啶-2-基
50	3-氯-5-二氟甲氧基吡啶-2-基
51	3-氯-5-甲基硫基吡啶-2-基

Het	R ⁵
52	3-氯-5-三氟甲基硫基吡啶-2-基
53	3-氯-5-甲基磺基吡啶-2-基
54	3-氟基-5-氯吡啶-2-基
55	3-氟基-5-氯吡啶-2-基
56	3,5-二氟基吡啶-2-基
57	3-氟基-5-甲基吡啶-2-基
58	3-氟基-5-乙基吡啶-2-基
59	3-氟基-5-異丙基吡啶-2-基
60	3-氟基-5-三氟甲基吡啶-2-基
61	3-氟基-5-甲氧基吡啶-2-基
62	3-氟基-5-乙氧基吡啶-2-基
63	3-氟基-5-二氟甲氧基吡啶-2-基
64	3-氟基-5-甲基硫基吡啶-2-基
65	3-氟基-5-三氟甲基硫基吡啶-2-基
66	3-氟基-5-甲基磺基吡啶-2-基
67	3-甲基-5-氯吡啶-2-基
68	3-甲基-5-氯吡啶-2-基
69	3-甲基-5-氟基吡啶-2-基
70	3,5-二甲基吡啶-2-基
71	3-甲基-5-乙基吡啶-2-基
72	3-甲基-5-異丙基吡啶-2-基
73	3-甲基-5-三氟甲基吡啶-2-基
74	3-甲基-5-甲氧基吡啶-2-基
75	3-甲基-5-乙氧基吡啶-2-基
76	3-甲基-5-二氟甲氧基吡啶-2-基
77	3-甲基-5-甲基硫基吡啶-2-基
78	3-甲基-5-三氟甲基硫基吡啶-2-基
79	3-甲基-5-甲基磺基吡啶-2-基
80	3-乙基-5-氯吡啶-2-基
81	3-乙基-5-氯吡啶-2-基
82	3-乙基-5-氟基吡啶-2-基
83	3-乙基-5-甲基吡啶-2-基
84	3,5-二乙基吡啶-2-基
85	3-乙基-5-異丙基吡啶-2-基
86	3-乙基-5-三氟甲基吡啶-2-基
87	5-甲氧基吡啶-2-基
88	5-乙氧基吡啶-2-基
89	3-乙基-5-二氟甲氧基吡啶-2-基
90	3-乙基-5-甲基硫基吡啶-2-基
91	3-乙基-5-三氟甲基硫基吡啶-2-基
92	3-乙基-5-甲基磺基吡啶-2-基
93	3-異丙基-5-氯吡啶-2-基
94	3-異丙基-5-氯吡啶-2-基

Het	R ⁵
95	3-異丙基-5-氟基吡啶-2-基
96	3-異丙基-5-甲基吡啶-2-基
97	3-異丙基-5-乙基吡啶-2-基
98	3,5-二異丙基吡啶-2-基
99	3-異丙基-5-三氟甲基吡啶-2-基
100	3-異丙基-5-甲氧基吡啶-2-基
101	3-異丙基-5-乙氧基吡啶-2-基
102	3-異丙基-5-二氟甲氧基吡啶-2-基
103	3-異丙基-5-甲基硫基吡啶-2-基
104	3-異丙基-5-三氟甲基硫基吡啶-2-基
105	3-異丙基-5-甲基磺醯基吡啶-2-基
106	3-三氟甲基-5-氟吡啶-2-基
107	3-三氟甲基-5-氯吡啶-2-基
108	3-三氟甲基-5-氟基吡啶-2-基
109	3-三氟甲基-5-甲基吡啶-2-基
110	3-三氟甲基-5-乙基吡啶-2-基
111	3-三氟甲基-5-異丙基吡啶-2-基
112	3,5-二(三氟甲基)吡啶-2-基
113	3-三氟甲基-5-甲氧基吡啶-2-基
114	3-三氟甲基-5-乙氧基吡啶-2-基
115	3-三氟甲基-5-二氟甲氧基吡啶-2-基
116	3-三氟甲基-5-甲基硫基吡啶-2-基
117	3-三氟甲基-5-三氟甲基硫基-吡啶-2-基
118	3-三氟甲基-5-甲基磺醯基-吡啶-2-基
119	3-甲氧基-5-氟吡啶-2-基
120	3-甲氧基-5-氯吡啶-2-基
121	3-甲氧基-5-氟基吡啶-2-基
122	3-甲氧基-5-甲基吡啶-2-基
123	3-甲氧基-5-乙基吡啶-2-基
124	3-甲氧基-5-異丙基吡啶-2-基
125	3-甲氧基-5-三氟甲基吡啶-2-基
126	3,5-二甲氧基吡啶-2-基
127	3-甲氧基-5-乙氧基吡啶-2-基
128	3-甲氧基-5-二氟甲氧基吡啶-2-基
129	3-甲氧基-5-甲基硫基吡啶-2-基
130	3-甲氧基-5-三氟甲基硫基-吡啶-2-基
131	3-甲氧基-5-甲基磺醯基吡啶-2-基
132	3-乙氧基-5-氟吡啶-2-基
133	3-乙氧基-5-氯吡啶-2-基
134	3-乙氧基-5-氟基吡啶-2-基

Het	R ⁵
135	3-乙氧基-5-甲基吡啶-2-基
136	3-乙氧基-5-乙基吡啶-2-基
137	3-乙氧基-5-異丙基吡啶-2-基
138	3-乙氧基-5-三氟甲基吡啶-2-基
139	3-乙氧基-5-甲氧基吡啶-2-基
140	3,5-二乙氧基吡啶-2-基
141	3-乙氧基-5-二氟甲氧基吡啶-2-基
142	3-乙氧基-5-甲基硫基吡啶-2-基
143	3-乙氧基-5-三氟甲基硫基吡啶-2-基
144	3-乙氧基-5-甲基磺醯基吡啶-2-基
145	3-二氟甲氧基-5-氟吡啶-2-基
146	3-二氟甲氧基-5-氯吡啶-2-基
147	3-二氟甲氧基-5-氟基吡啶-2-基
148	3-二氟甲氧基-5-甲基吡啶-2-基
149	3-二氟甲氧基-5-乙基吡啶-2-基
150	3-二氟甲氧基-5-異丙基吡啶-2-基
151	3-二氟甲氧基-5-三氟甲基-吡啶-2-基
152	3-二氟甲氧基-5-甲氧基吡啶-2-基
153	3-二氟甲氧基-5-乙氧基吡啶-2-基
154	3,5-二(二氟甲氧基)吡啶-2-基
155	3-二氟甲氧基-5-甲基硫基-吡啶-2-基
156	3-二氟甲氧基-5-三氟甲基硫基吡啶-2-基
157	3-二氟甲氧基-5-甲基磺醯基-吡啶-2-基
158	3-甲基硫基-5-氟吡啶-2-基
159	3-甲基硫基-5-氯吡啶-2-基
160	3-甲基硫基-5-氟基吡啶-2-基
161	3-甲基硫基-5-甲基吡啶-2-基
162	3-甲基硫基-5-乙基吡啶-2-基
163	3-甲基硫基-5-異丙基吡啶-2-基
164	3-甲基硫基-5-三氟甲基吡啶-2-基
165	3-甲基硫基-5-甲氧基吡啶-2-基
166	3-甲基硫基-5-乙氧基吡啶-2-基
167	3-甲基硫基-5-二氟甲氧基-吡啶-2-基
168	3,5-二(甲基硫基)吡啶-2-基
169	3-甲基硫基-5-三氟甲基硫基-吡啶-2-基
170	3-甲基硫基-5-甲基磺醯基吡啶-2-基
171	3-三氟甲基硫基-5-氟吡啶-2-基
172	3-三氟甲基硫基-5-氯吡啶-2-基

Het	R ⁵
173	3-三氟甲基硫基-5-氟基吡啶-2-基
174	3-三氟甲基硫基-5-甲基吡啶-2-基
175	3-三氟甲基硫基-5-乙基吡啶-2-基
176	3-三氟甲基硫基-5-異丙基-吡啶-2-基
177	3-三氟甲基硫基-5-三氟甲基-吡啶-2-基
178	3-三氟甲基硫基-5-甲氧基-吡啶-2-基
179	3-三氟甲基硫基-5-乙氧基吡啶-2-基
180	3-三氟甲基硫基-5-二氟-甲氧基吡啶-2-基
181	3-三氟甲基硫基-5-甲基硫基-吡啶-2-基
182	3,5-二(三氟甲基硫基)吡啶-2-基
183	3-三氟甲基硫基-5-甲基磺醯基-吡啶-2-基
184	3-甲基磺醯基-5-氟吡啶-2-基
185	3-甲基磺醯基-5-氯吡啶-2-基
186	3-甲基磺醯基-5-氟基吡啶-2-基
187	3-甲基磺醯基-5-甲基吡啶-2-基
188	3-甲基磺醯基-5-乙基吡啶-2-基
189	3-甲基磺醯基-5-異丙基-吡啶-2-基
190	3-甲基磺醯基-5-三氟甲基-吡啶-2-基
191	3-甲基磺醯基-5-甲氧基吡啶-2-基
192	3-甲基磺醯基-5-乙氧基吡啶-2-基
193	3-甲基磺醯基-5-二氟甲氧基-吡啶-2-基
194	3-甲基磺醯基-5-甲基硫基吡啶-2-基
195	3-甲基磺醯基-5-三氟甲基硫基-吡啶-2-基
196	3,5-二(甲基磺醯基)吡啶-2-基
197	吡啶-3-基
198	6-氟吡啶-3-基
199	6-氯吡啶-3-基
200	6-氟基吡啶-3-基
201	6-甲基吡啶-3-基
202	6-乙基吡啶-3-基
203	6-異丙基吡啶-3-基
204	6-三氟甲基吡啶-3-基
205	6-甲氧基吡啶-3-基

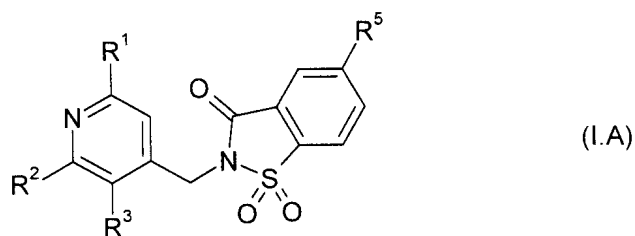
Het	R ⁵
206	6-乙氧基吡啶-3-基
207	6-二氟甲氧基吡啶-3-基
208	6-甲基硫基吡啶-3-基
209	6-三氟甲基硫基吡啶-3-基
210	6-甲基磺醯基吡啶-3-基
211	異噁唑-3-基
212	5-氟異噁唑-3-基
213	5-氯異噁唑-3-基
214	5-氟基異噁唑-3-基
215	5-甲基異噁唑-3-基
216	5-乙基異噁唑-3-基
217	5-異丙基異噁唑-3-基
218	5-三氟甲基異噁唑-3-基
219	5-甲氧基異噁唑-3-基
220	5-乙氧基異噁唑-3-基
221	5-二氟甲氧基異噁唑-3-基
222	5-甲基硫基異噁唑-3-基
223	5-三氟甲基硫基異噁唑-3-基
224	5-甲基磺醯基異噁唑-3-基
225	異噻唑-3-基
226	5-氟異噻唑-3-基
227	5-氯異噻唑-3-基
228	5-氟基異噻唑-3-基
229	5-甲基異噻唑-3-基
230	5-乙基異噻唑-3-基
231	5-異丙基異噻唑-3-基
232	5-三氟甲基異噻唑-3-基
233	5-甲氧基異噻唑-3-基
234	5-乙氧基異噻唑-3-基
235	5-二氟甲氧基異噻唑-3-基
236	5-甲基硫基異噻唑-3-基
237	5-三氟甲基硫基異噻唑-3-基
238	5-甲基磺醯基異噻唑-3-基
239	1,2,4-噁二唑-3-基
240	5-氟-1,2,4-噁二唑-3-基
241	5-氯-1,2,4-噁二唑-3-基
242	5-氟基-1,2,4-噁二唑-3-基
243	5-甲基-1,2,4-噁二唑-3-基
244	5-乙基-1,2,4-噁二唑-3-基
245	5-異丙基-1,2,4-噁二唑-3-基
246	5-三氟甲基-1,2,4-噁二唑-3-基
247	5-甲氧基-1,2,4-噁二唑-3-基
248	5-乙氧基-1,2,4-噁二唑-3-基

Het	R ⁵
249	5-二氟甲氧基-1,2,4-噁二唑-3-基
250	5-甲基硫基-1,2,4-噁二唑-3-基
251	5-三氟甲基硫基-1,2,4-噁二唑-3-基
252	5-甲基磺醯基-1,2,4-噁二唑-3-基
253	1,2,4-噻二唑-3-基
254	5-氟異噁唑-3-基
255	5-氯異噁唑-3-基
256	5-氰基異噁唑-3-基
257	5-甲基異噁唑-3-基

Het	R ⁵
258	5-乙基異噁唑-3-基
259	5-異丙基異噁唑-3-基
260	5-三氟甲基異噁唑-3-基
261	5-甲氧基異噁唑-3-基
262	5-乙氧基異噁唑-3-基
263	5-二氟甲氧基異噁唑-3-基
264	5-甲基硫基異噁唑-3-基
265	5-三氟甲基硫基異噁唑-3-基
266	5-甲基磺醯基異噁唑-3-基

就其用途而言，特別較佳為下表中所彙編之式(I)磺醯胺化合物。此外，表中作為取代基提及之基團本身(與其所提及於其中之組合無關)為所討論之取代基之特別較佳實施例。

本發明之一特定實施例係關於式(I)磺醯胺化合物，其中m為0，X為O，Y為CH且Z為一化學鍵，在下文中稱為式(I.A)磺醯胺化合物，



其中R¹、R²、R³及R⁵具有以上所給之含義，尤其提及為較佳之彼等含義。

表1(化合物(I.A-Ar.1-1)至(I.A-Ar.1-282))

式(I.A)化合物，其中R⁵為如表B第1列中所定義之基團(Ar.1)，且R¹、R²及R³具有一種對應於表A任一系列之含義。

表2至122(化合物(I.A-Ar.2-1)至(I.A-Ar.122-282))

式(I.A)化合物，其中R⁵為如表B第2至122列中所定義之

基團(Ar.2)至(Ar.122)中之一者，且 R^1 、 R^2 及 R^3 具有一種對應於表A任一列之含義。

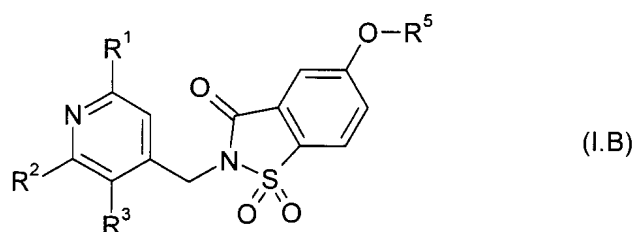
表123(化合物(I.A-Het.1-1)至(I.A-Het.1-282))

式(I.A)化合物，其中 R^5 為如表C第1列中所定義之基團(Het.1)，且 R^1 、 R^2 及 R^3 具有一種對應於表A任一列之含義。

表124至388(化合物(I.A-Het.2-1)至(I.A-Het.266-282))

式(I.A)化合物，其中 R^5 為如表C第2至266列中所定義之基團(Het.2)至(Het.266)中之一者，且 R^1 、 R^2 及 R^3 具有一種對應於表A任一列之含義。

本發明之另一特定實施例係關於式(I)磺醯胺化合物，其中 m 為0， X 為O， Y 為CH且 Z 為O，在下文中稱為式(I.B)磺醯胺化合物，



其中 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^5 具有以上所給之含義，尤其提及為較佳之彼等含義。

表389(化合物(I.B-Ar.1-1)至(I.B-Ar.1-282))

式(I.B)化合物，其中 R^5 為如表B第1列中所定義之基團(Ar.1)，且 R^1 、 R^2 及 R^3 具有一種對應於表A任一列之含義。

表390至510(化合物(I.B-Ar.2-1)至(I.B-Ar.122-282))

式(I.B)化合物，其中 R^5 為如表B第2至122列中所定義之

基團 (Ar.2) 至 (Ar.122) 中之一者，且 R^1 、 R^2 及 R^3 具有一種對應於表 A 任一列之含義。

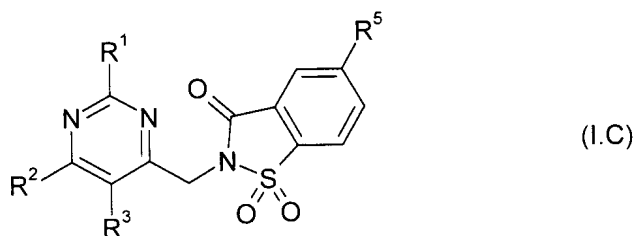
表 511 (化合物 (I.B-Het.1-1) 至 (I.B-Het.1-282))

式 (I.B) 化合物，其中 R^5 為如表 C 第 1 列中所定義之基團 (Het.1)，且 R^1 、 R^2 及 R^3 具有一種對應於表 A 任一列之含義。

表 512 至 776 (化合物 (I.B-Het.2-1) 至 (I.B-Het.266-282))

式 (I.B) 化合物，其中 R^5 為如表 C 第 2 至 266 列中所定義之基團 (Het.2) 至 (Het.266) 中之一者，且 R^1 、 R^2 及 R^3 具有一種對應於表 A 任一列之含義。

本發明之另一特定實施例係關於式 (I) 磺醯胺化合物，其中 m 為 0， X 為 O， Y 為 N 且 Z 為一化學鍵，在下文中稱為式 (I.C) 磺醯胺化合物，



其中 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^5 具有以上所給之含義，尤其提及為較佳之彼等含義。

表 777 (化合物 (I.C-Ar.1-1) 至 (I.C-Ar.1-282))

式 (I.C) 化合物，其中 R^5 為如表 B 第 1 列中所定義之基團 (Ar.1)，且 R^1 、 R^2 及 R^3 具有一種對應於表 A 任一列之含義。

表 778 至 898 (化合物 (I.C-Ar.2-1) 至 (I.C-Ar.122-282))

式 (I.C) 化合物，其中 R^5 為如表 B 第 2 至 122 列中所定義之

基團 (Ar.2) 至 (Ar.122) 中之一者，且 R^1 、 R^2 及 R^3 具有一種對應於表 A 任一列之含義。

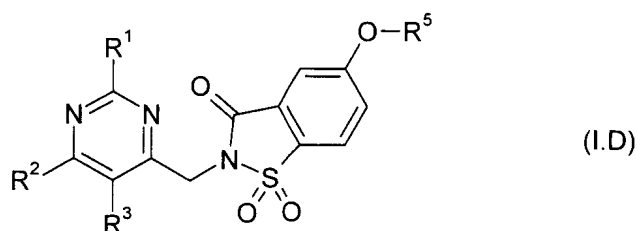
表 899 (化合物 (I.C-Het.1-1) 至 (I.C-Het.1-282))

式 (I.C) 化合物，其中 R^5 為如表 C 第 1 列中所定義之基團 (Het.1)，且 R^1 、 R^2 及 R^3 具有一種對應於表 A 任一列之含義。

表 900 至 1164 (化合物 (I.C-Het.2-1) 至 (I.C-Het.266-282))

式 (I.C) 化合物，其中 R^5 為如表 C 第 2 至 266 列中所定義之基團 (Het.2) 至 (Het.266) 中之一者，且 R^1 、 R^2 及 R^3 具有一種對應於表 A 任一列之含義。

本發明之又一特定實施例係關於式 (I) 磺醯胺化合物，其中 m 為 0， X 為 O， Y 為 N 且 Z 為 O，在下文中稱為式 (I.D) 磺醯胺化合物，



其中 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^5 具有以上所給之含義，尤其提及為較佳之彼等含義。

表 1165 (化合物 (I.D-Ar.1-1) 至 (I.D-Ar.1-282))

式 (I.D) 化合物，其中 R^5 為如表 B 第 1 列中所定義之基團 (Ar.1)，且 R^1 、 R^2 及 R^3 具有一種對應於表 A 任一列之含義。

表 1166 至 1286 (化合物 (I.D-Ar.2-1) 至 (I.D-Ar.122-282))

式 (I.D) 化合物，其中 R^5 為如表 B 第 2 至 122 列中所定義之

基團 (Ar.2) 至 (Ar.122) 中之一者，且 R^1 、 R^2 及 R^3 具有一種對應於表 A 任一列之含義。

表 1287 (化合物 (I.D-Het.1-1) 至 (I.D-Het.1-282))

式 (I.D) 化合物，其中 R^5 為如表 C 第 1 列中所定義之基團 (Het.1)，且 R^1 、 R^2 及 R^3 具有一種對應於表 A 任一列之含義。

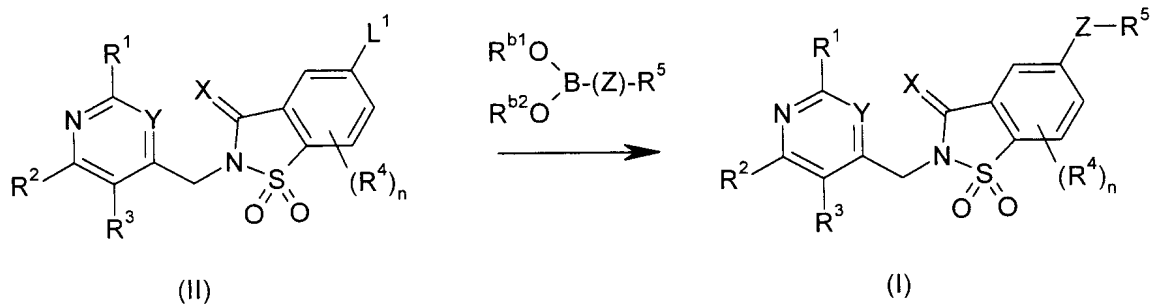
表 1288 至 1552 (化合物 (I.D-Het.2-1) 至 (I.D-Het.266-282))

式 (I.D) 化合物，其中 R^5 為如表 C 第 2 至 266 列中所定義之基團 (Het.2) 至 (Het.266) 中之一者，且 R^1 、 R^2 及 R^3 具有一種對應於表 A 任一列之含義。

本發明之式 (I) 化合物可藉由類似於本來已知之製備聯苯化合物之先前技術方法及本來已知之製備如糖精衍生物之磺醯亞胺化合物之方法的多種途徑來製備。有利地，其可如流程 1 至 5 中所概述獲得。

一般而言，式 (I) 磺醯亞胺化合物可如流程 1 中所示、藉由鈴木偶合 (Suzuki coupling) 使式 (II) 化合物與式 R^5 -(Z)-B(OR^{1a})(OR^{1b}) 之酮酸衍生物反應來製備。

流程 1：



在流程 1 中， R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、X、Y、Z 及 n 係如以

上所定義， R^{b1} 及 R^{b2} 各自獨立地為氫或 C^1-C^4 烷基，或 R^{b1} 及 R^{b2} 一起形成碳原子未經取代或可全部或部分經甲基取代之1,2-伸乙基部分，且 L^1 為合適離去基。合適離去基 L^1 為鹵素(較佳為氯、溴或碘)、烷基羧酸酯基、苯甲酸酯基、烷基磺酸酯基、鹵烷基磺酸酯基或芳基磺酸酯基，最佳為氯或溴。

反應通常在鹼及觸媒、特別鈀觸媒存在下進行，諸如以下文獻中所描述：Synth. Commun.第11卷第513頁(1981)；Acc. Chem. Res.第15卷第178-184頁(1982)；Chem. Rev.第95卷第2457-2483頁(1995)；Organic Letters第6卷(16)，第2808頁(2004)；「Metal catalyzed cross coupling reactions」，第2版，Wiley, VCH 2005 (De Meijere, Diederich 編)；「Handbook of organopalladium chemistry for organic synthesis」(Negishi 編)，Wiley, Interscience, New York, 2002；「Handbook of functionalized organometallics」，(P. Knochel 編)，Wiley, VCH, 2005。

合適之觸媒為肆(三苯膦)鈀(0)；雙(三苯膦)氯化鈀(II)；雙(乙腈)氯化鈀(II)；[1,1'-雙(二苯膦基)二茂鐵]-氯化鈀(II)/二氯甲烷(1:1)錯合物；雙[雙-(1,2-二苯膦基)乙烷]鈀(0)；雙(雙-(1,2-二苯膦基)丁烷-氯化鈀(II)；乙酸鈀(II)；氯化鈀(II)；及乙酸鈀(II)/三-鄰甲苯基膦錯合物或膦與鈀鹽之混合物或膦與鈀錯合物之混合物，例如二亞苄基丙酮-鈀與三-第三丁基膦(或其四氟硼酸鹽)、三環己基膦之混合物；或聚合物結合之鈀-三苯膦觸媒系統。

合適之鹼通常為無機化合物，諸如鹼金屬及鹼土金屬氧化物，諸如氧化鋰、氧化鈉、氧化鈣及氧化鎂；鹼金屬及鹼土金屬碳酸鹽，諸如碳酸鋰、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸銨及碳酸鈣；以及鹼金屬碳酸氫鹽，諸如碳酸氫鈉；鹼金屬及鹼土金屬醇鹽，諸如甲醇鈉、乙醇鈉、乙醇鉀及第三丁醇鉀；此外可為有機鹼，例如三級胺，諸如三甲胺、三乙胺、二異丙基乙胺；及N-甲基哌啶；吡啶；經取代之吡啶，諸如三甲基吡啶(collidine)、二甲基吡啶(lutidine)及4-二甲胺基吡啶；以及雙環胺。尤其較佳為諸如碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸銨、三乙胺及碳酸氫鈉之鹼。

鹼相對於化合物(II)以1:1至1:10、較佳1:1.5至1:5範圍內之莫耳比使用，醕酸相對於化合物(II)以1:1至1:5、較佳1:1至1:2.5範圍內之莫耳比使用。在一些狀況下，相對於化合物(II)使用0.7:1至0.99:1範圍內之亞化學計量莫耳比的醕酸可能有益於簡單純化。

反應通常在惰性有機溶劑中進行。合適溶劑為脂族烴，諸如戊烷、己烷、環己烷及石油醚；芳族烴，諸如甲苯、鄰二甲苯、間二甲苯及對二甲苯；醚，諸如二異丙醚、第三丁基甲醚、二噁烷、苯甲醚及四氫呋喃及二甲氧基乙烷；酮，諸如丙酮、甲基乙基酮、二乙基酮及第三丁基甲基酮；以及二甲亞砜、二甲基甲醯胺及二甲基乙醯胺，尤其較佳為醚，諸如四氫呋喃、二噁烷及二甲氧基乙烷。亦可使用所提及之溶劑之混合物或其與水之混合物。

反應通常在20°C至180°C、較佳40°C至120°C之溫度下進

行。

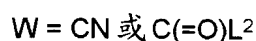
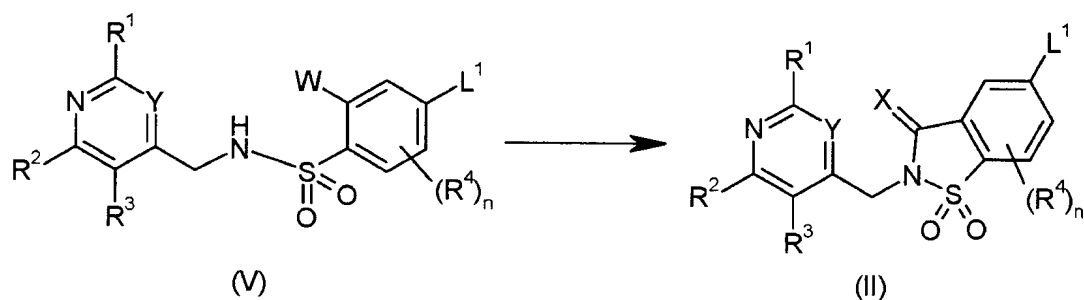
反應完成之後，可藉由使用習知方法分離式(I)化合物，諸如將反應混合物添加至水中、用有機溶劑萃取、濃縮萃取液及其類似方法。必要時，可藉由諸如層析、再結晶及其類似方法之技術純化所分離之化合物(I)。

亦可將淨化劑添加至反應混合物中以藉由與副產物或未反應之起始物質結合且簡單過濾來移除彼等物質。詳情請參見「Synthesis and purification catalog」，Argonaut, 2003及其中引用的文獻。

式 $R^5-(Z)-B(OR^{1a})(OR^{1b})$ 之酮酸或酯可自市面上購得或可根據以下文獻製備：「Science of Synthesis」第6卷，Thieme, 2005；WO 02/042275；Synlett 2003, (8)第1204頁；J. Org. Chem., 2003, 68, 第3729頁；Synthesis, 2000, 第442頁；J. Org. Chem., 1995, 60, 第750頁；或「Handbook of functionalized organometallics」，(P. Knochel編)，Wiley, VCH, 2005。

其中X為O或NH的化合物(II)可如流程2中所示、藉由式(V)磺醯胺化合物之分子內環化作用獲得。

流程2：



在流程2中， L^1 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、Y及n係如以上所定義，且W為CN或 $-C(=O)L^2$ ，其中 L^2 為離去基，諸如鹵素或烷氧基，較佳 C_1 - C_4 烷氧基。

可根據US 5 981 758中所概述之方法執行磺醯胺(V)至亞胺基糖精(II)(其中X為NH)的環化。反應通常在惰性有機溶劑中、在鹼存在下進行。合適溶劑為脂族烴，諸如戊烷、己烷、環己烷及石油醚；芳族烴，諸如甲苯、鄰二甲苯、間二甲苯及對二甲苯；醚，諸如二異丙醚、第三丁基甲醚、二噁烷、苯甲醚及四氫呋喃及二甲氧基乙烷；酮，諸如丙酮、甲基乙基酮、二乙基酮及第三丁基甲基酮；以及二甲亞砷、二甲基甲醯胺及二甲基乙醯胺。亦可使用所提及之溶劑之混合物或其與水之混合物。尤其較佳為使用醚(諸如四氫呋喃、二噁烷及二甲氧基乙烷)或芳族烴(諸如甲苯)與水之混合物。

反應通常在 0°C 至 80°C 、較佳 10°C 至 25°C 之溫度下進行。

合適鹼通常為無機化合物，諸如鹼金屬及鹼土金屬氧化物，諸如氧化鋰、氧化鈉、氧化鈣及氧化鎂；鹼金屬及鹼土金屬碳酸鹽，諸如碳酸鋰、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸銨及碳酸鈣；以及鹼金屬碳酸氫鹽，諸如碳酸氫鈉；鹼金屬及鹼土金屬醇鹽，諸如甲醇鈉、乙醇鈉、乙醇鉀及第三丁醇鉀；此外可為有機鹼，例如三級胺，諸如三甲胺、三乙胺、二異丙基乙胺；及N-甲基哌啶；吡啶；經取代之吡啶，諸如三甲基吡啶、二甲基吡啶及4-二甲基氨基吡啶；

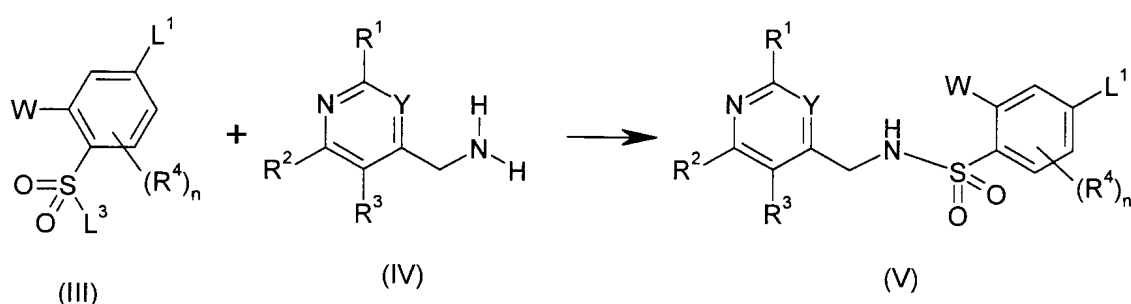
以及雙環胺。尤其較佳為諸如碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸銨、三乙胺及碳酸氫鈉之鹼。

接著可藉由水解作用使其中X為NH之式(II)亞胺基糖精化合物轉化為其中X為O之式(II)糖精化合物(參看製備實例I.4)或藉由與式 R^x -LG(其中LG為合適離去基, 諸如鹵素、烷基磺酸酯基或芳基磺酸酯基)烷化劑或醯化劑反應轉化為其中X為 NR^x (其中 R^x 不為氫)之式(II)亞胺基糖精化合物。

根據US 5 981 758中所概述之方法進行式(II)亞胺基糖精化合物之酸水解。多種酸可用於水解作用, 例如(但不限於)氫氯酸、氫溴酸、三氟甲磺酸、三氟乙酸、乙酸及甲烷磺酸。合適溶劑包括水性溶劑與有機溶劑。酸與溶劑之較佳組合為水性二噁烷中之氫氯酸。

化合物(V)可如流程3中所示、藉由使磺醯氯(III)與胺基化合物(IV)反應獲得。

流程3：



在流程3中, L^1 、 L^2 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 W 、 Y 及 n 係如以上所定義, 且 L^3 為離去基, 諸如羥基或鹵素, 較佳氯。

可根據有機化學之標準方法(例如參見Lieb. Ann. Chem.

第 641 頁，1990 或 WO 2005/033081) 執行磺醯基化合物(III) 與胺基化合物(IV)之反應。

反應通常在惰性有機溶劑中進行。合適溶劑為脂族烴，諸如戊烷、己烷、環己烷及石油醚；芳族烴，諸如甲苯、鄰二甲苯、間二甲苯及對二甲苯；鹵化烴，諸如二氯甲烷、三氯甲烷及氯苯；醚，諸如乙醚、二異丙醚、第三丁基甲醚、二噁烷、苯甲醚及四氫呋喃；腈，諸如乙腈及丙腈；酮，諸如丙酮、甲基乙基酮、二乙基酮及第三丁基甲基酮；以及二甲亞砷；二甲基甲醯胺及二甲基乙醯胺，較佳為四氫呋喃、甲基第三基醚、二氯甲烷、三氯甲烷、乙腈、甲苯或二甲基甲醯胺。亦可使用所提及之溶劑之混合物。

在鹼存在下進行反應可為有利的。合適鹼通常為無機化合物，諸如鹼金屬及鹼土金屬氫氧化物，諸如氫氧化鋰、氫氧化鈉、氫氧化鉀及氫氧化鈣；鹼金屬及鹼土金屬氧化物，諸如氧化鋰、氧化鈉、氧化鈣及氧化鎂；鹼金屬及鹼土金屬氫化物，諸如氫化鋰、氫化鈉、氫化鉀及氫化鈣；鹼金屬及鹼土金屬碳酸鹽，諸如碳酸鋰、碳酸鉀及碳酸鈣；以及鹼金屬碳酸氫鹽，諸如碳酸氫鈉；此外可為有機鹼，例如三級胺，諸如三甲胺、三乙胺、二異丙基乙胺；及 N-甲基哌啶；吡啶；經取代之吡啶，諸如三甲基吡啶、二甲基吡啶及 4-二甲基胺基吡啶；以及雙環胺。尤其較佳為吡啶、三乙胺及碳酸鉀。鹼通常以等莫耳量、過量或適當時作為溶劑使用。相對於 1 莫耳化合物(IV)，通常鹼過

量 0.5 至 5 莫耳。

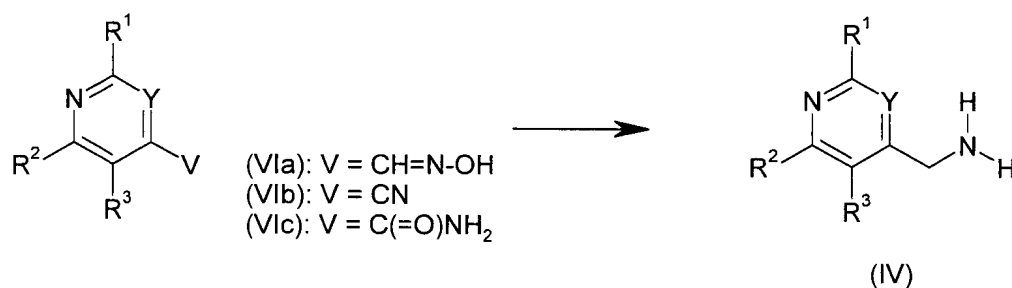
反應通常在 -30°C 至 120°C 、較佳 -10°C 至 100°C 之溫度下進行。

起始物質彼此間通常以等莫耳量反應。

若磺醯基化合物(III)不可自市面上購得，則其可根據此項技術已知之程序獲得，例如可藉由磺醯化置換合適胺基前驅物之胺基來獲得合適之式(III)化合物(參看製備實例 I.1.1)。

胺基化合物(IV)可經文獻獲知或可自市面上購得，或其可由前驅物(VIa)至(VIc)(其中 V 如流程 4 中所定義)藉由還原製備。

流程 4：



該還原之方法可見於文獻中，例如：Houben-Weyl, Band 10/4, Thieme, Stuttgart, 1968；Band 11/2, 1957；Band E5, 1985；J. Heterocycl. Chem., 1997, 34 (6)，第 1661-1667 頁；J. Chem. Soc. 1954，第 1165 頁；Heterocycles, 41(4)，第 675-688 頁，1995；J. Org. Chem., 1982, 47，第 3153 頁；Heterocycles, 1996, 43 (9)，第 1893-1900 頁；J. Prakt. Chem-Chem. Ztg. 336(8)，第 695-697 頁，1994；或為熟習此項技術者所知。

肟(VIa)可如以下文獻中所述由相應的醛($V=CHO$ ；化合物(VId))或甲基衍生物($V=CH_3$ ；化合物(VIe))製備：Houben-Weyl, Band 10/4, Thieme, Stuttgart, 1968；Band 11/2, 1957；Band E5, 1985；J. Prakt. Chem-Chem. Ztg. 336(8)，第695-697頁，1994；Tetrahedron Lett. 42(39)，第6815-6818頁，2001或Heterocycles, 29(9)，第1741-1760頁，1989。

醛(VId)可自市面上購得(吡啶-4-甲醛、喹啉-4-甲醛、2-氯吡啶-4-甲醛)或可由4-甲基吡啶或4-甲基嘧啶以類似於J. Org. Chem. 51(4)，第536-537頁，1986中描述之方法合成，或如Eur. J. Org. Chem., 2003, (8)，第1576-1588頁；Tetrahedron Lett. 1999, 40 (19)，第3719-3722頁；Tetrahedron, 1999, 55 (41)，第12149-12156頁中所展示由鹵基衍生物($V=$ 鹵素，化合物(VIf))合成。

甲基衍生物(VIe)可自市面上購得(例如4-甲基吡啶、3-氯基-2,6-二氯-4-甲基吡啶、4-甲基喹啉、6-氯-4-甲基喹啉、6,8-二甲氧基-喹啉、4-甲基嘧啶、4,6-二甲基嘧啶)或可類似於「Science of Synthesis」，第15卷，Thieme, Stuttgart, 2005合成。

腈(VIb)可由相應的鹵素衍生物(VIf)($V=$ 鹵素，較佳氯、溴或碘)藉由在有或無額外觸媒下與氰化物源反應製備，如例如以下文獻中所描述：Tetrahedron Lett. 42(38)，第6707-6710頁，2001；Chem. Eur. J., 2003, 9 (8)，第1828-1836頁；Chem. Commun. (Cambridge), 2004, (12)，第1388-1389頁；J. Organomet. Chem. 2004, 689 (24)，第4576-

4583頁或J. Chem. Soc. Perk. T., 1 (16), 第2323-2326頁, 1999。或者, 可如以下文獻中所概述使醯胺或肟脫水成相應腈(VIb): 「Synthesis」, Stuttgart, (10), 第943-944頁, 1992或其中引用的文獻或Heterocycl. Chem. 1997, 34 (6), 第1661-1667頁。

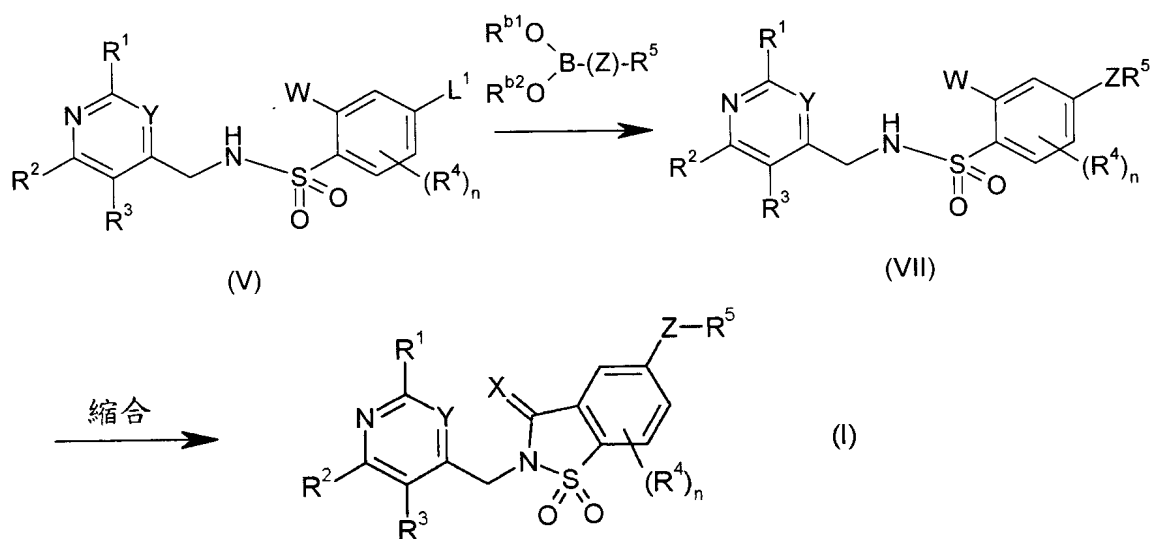
4-鹵素喹啉(化合物VI f, 其中Y為 CR^Y 且 R^2 連同 R^3 一起形成稠合苯環)可自市面上購得或可根據「Science of Synthesis」, 第15卷, Thieme, Stuttgart, 2005或例如根據以下文獻或其中引用的文獻合成: 4-氯-6,7-二甲氧基-喹啉: Journal Med. Chem. 48(5), 第1359頁, 2005; 4-氯-5,7-二氯-喹啉: Indian, 187817, 2002年6月29日; 4-氯-7-氯-喹啉: Tetrahedron, 60 (13), 第3017頁, 2004; 4-氯-7-三氯甲基-喹啉: Tetrahedron Lett., 31(8), 第1093頁, 1990; 4-氯-7,8-二甲氧基-喹啉: Tetrahedron, 41 (15), 第3033頁, 1985; 4-氯-8-甲氧基-喹啉: Chem. Berichte 118(4), 第1556頁, 1985; 4-氯-(6或7或8)-碘-喹啉、4-溴-(6或7或8)-碘-喹啉、4-碘-(6或7或8)-碘-喹啉: J. Med. Chem., 21(3), 第268頁, 1978。

構建適當前驅物或改變取代型式之其他方法可見於「Synthesis」, Stuttgart (1), 第31-32頁, 1993; Tetrahedron, 1993, 49 (24), 第5315-5326頁; 「Methods in Science of Synthesis」, Band 15及其中引用的文獻; Bioorg. Med. Chem. Lett. 1997, 7 (23), 第2935-2940頁; J. Am. Chem. Soc., 1946, 68, 第1264頁; Org. Synth. 1955, III, 第272頁。

在一些狀況下，使化合物(VI)還原化合物(IV)及胺(IV)與化合物(III)在一鍋中反應而不分離化合物(IV)就易於處理或純化而言可為有益的。

或者，可如流程5中所示，藉由首先使式(V)化合物與酮酸衍生物 $R^5-(Z)-B(OR^{b1})(OR^{b2})$ 反應且接著使所得偶合產物(VII)進行分子內環化作用來獲得式(I)化合物。

流程5：

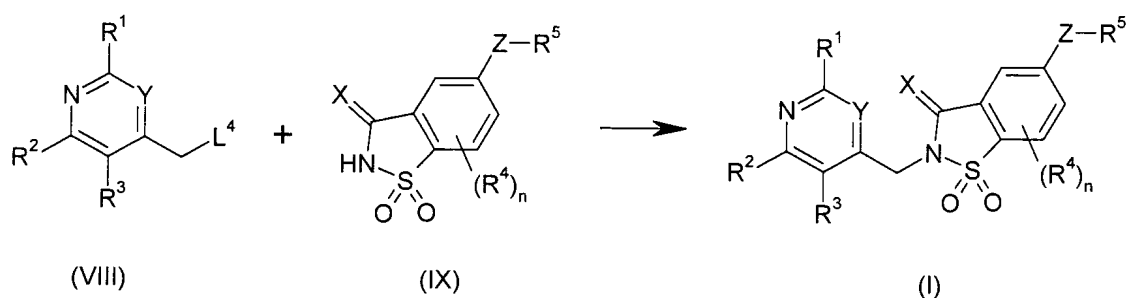


該反應順序之條件對應於之前關於鈴木偶合及分子內環化作用所概述之條件。

在一些狀況下，使化合物(V)與酮酸衍生物偶合形成化合物(VII)且接著在一鍋中使化合物(VII)發生分子內環化形成化合物(I)而不分離化合物(VII)就易於處理或純化而言可為有益的。

或者，可如流程6中所示，藉由使式(VIII)之吡啶或嘓啶化合物與式(IX)之糖精或亞胺基糖精衍生物反應獲得式(I)化合物。

流程 6：



在流程 6 中， R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 X 、 Y 、 Z 及 n 係如以上所定義，且 L^4 為合適離去基，諸如鹵素、烷基磺酸酯基或芳基磺酸酯基。

若個別化合物(I)不能由如上所述之途徑獲得，則其可藉由其他化合物(I)之衍生化或藉由常規修改所描述之合成途徑來製備。

式(I)化合物之製備可能使其以異構物混合物(立體異構物、對映異構物)之形式獲得。必要時，該等混合物可藉由用於該目的之常規方法(諸如結晶或層析，以及經由光學活性吸附質)拆分以獲得純異構物。

可根據習知氧化方法、由化合物(I)製備N-氧化物，例如藉由諸如間氯過苯甲酸之有機過氧酸[Journal of Medicinal Chemistry, 38(11), 1892-1903 (1995); WO 03/64572]或諸如過氧化氫之無機氧化劑[參見 Journal of Heterocyclic Chemistry, 18(7), 1305-8 (1981)]或過硫酸氫鉀(oxone)[參見 Journal of the American Chemical Society, 123(25), 5962-5973 (2001)]處理化合物(I)製備。

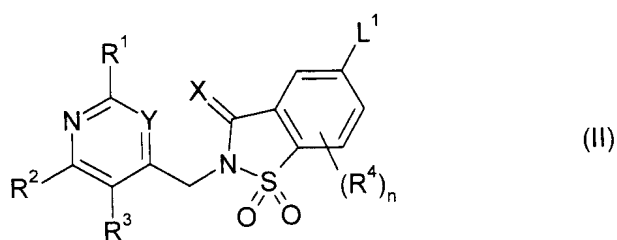
因此，本發明之一態樣係關於製備如以上所定義之式(I)

磺醯胺化合物之方法，該方法包含使如以上所定義之式(II)化合物與式 $R^5-(Z)-B(OR^{b1})(OR^{b2})$ 之醯酸衍生物在鹼及過渡金屬觸媒存在下反應以得到式(I)磺醯胺化合物。在一實施例中，式(I)磺醯胺化合物之該製備方法另外包含使如以上所定義之式(III)磺醯基化合物與如以上所定義之式(IV)胺基化合物在鹼存在下反應以得到如以上所定義之式(V)化合物，接著使其進行分子內環化以得到如以上所定義之式(II)化合物。

本發明之另一態樣係關於製備如以上所定義之式(I)磺醯胺化合物之方法，該方法包含使所得化合物(VII)進行分子內環化以得到如以上所定義之式(I)磺醯胺化合物。在一實施例中，式(V)磺醯胺化合物之該製備方法另外包含使如以上所定義之式(V)化合物與如以上所定義之式 $R^5-(Z)-B(OR^{b1})(OR^{b2})$ 之醯酸衍生物在鹼及過渡金屬觸媒存在下反應以得到如以上所定義之式(VII)磺醯胺化合物。

本發明之另一態樣係關於製備如以上所定義之式(I)磺醯胺化合物之方法，該方法包含如流程6中所示使式(VIII)之吡啶或嘧啶化合物與式(IX)之糖精或亞胺基糖精衍生物反應。

式(II)中間物係新穎的。因此，本發明之另一態樣係關於式(II)磺醯胺化合物，



其中 L^1 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 n 、 X 及 Y 具有之前關於式(I)化合物所定義之含義中之一種且其中 L^1 為合適離去基，諸如鹵素(較佳氯、溴或碘)、烷基羧酸酯基、苯甲酸酯基、烷基磺酸酯基或芳基磺酸酯基。 L^1 較佳為鹵素，尤其氯或溴。

以上關於式(I)化合物之變數之較佳實施例所作之說明相應適用於式(II)化合物之變數。

式(I)化合物因其極佳活性而可用於防治有害動物。

因此，本發明亦提供防治有害動物之方法，該方法包含用殺有害生物有效量之如本文中所定義之式(I)化合物或其鹽或N-氧化物或組合物處理害蟲、其食物源、其棲息地或其滋生地，或害蟲正生長或可生長於其中之栽培植物、植物繁殖材料(諸如種子)、土壤、區域、材料或環境，或欲保護以免遭害蟲侵襲或侵染之材料、栽培植物、植物繁殖材料(諸如種子)、土壤、表面或空間。

在一特殊實施例中，本發明方法用於保護植物繁殖材料(諸如種子)及由其生長之植物以免遭有害動物侵襲或侵染且包含用殺有害生物有效量之如以上所定義之式(I)化合物或其農業上可接受之鹽或N-氧化物或用殺有害生物有效量之如以上及以下所定義之農業組合物處理植物繁殖材料(諸如種子)。本發明方法不限於保護已根據本發明處理之「基質」(植物、植物繁殖材料、土壤材料等材料)，而且對由經處理之植物繁殖材料(諸如種子)生長之植物(該植物本身未經處理)具有預防作用，從而具有例如相應的保護

作用。

就本發明之意義而言，「有害動物」較佳選自無脊椎動物害蟲，特別選自節肢動物及線蟲，更佳選自有害昆蟲、蜘蛛類動物及線蟲，且甚至更佳選自昆蟲。在本發明之另一實施例中，「有害動物」係選自齧齒動物及除人類以外之其他有害脊椎動物，諸如。

本發明進一步提供對抗該等有害動物之農業組合物，其包含一定量之至少一種式(I)化合物或其至少一種農業上適用之鹽或其N-氧化物及至少一種具有殺有害生物作用之惰性液體及/或農藝上可接受之固體載劑及必要時至少一種界面活性劑。

根據本發明，該組合物可含有式(I)之單一活性化合物或其鹽或N-氧化物，或式(I)之多種活性化合物或其鹽或其N-氧化物之混合物。本發明之組合物可包含個別異構物或異構物之混合物以及個別互變異構物或互變異構物之混合物。

式(I)化合物、其鹽及其N-氧化物及包含其之殺有害生物組合物為防治無脊椎動物害蟲、特別節肢動物害蟲及線蟲之有效藥劑。由式(I)化合物防治之有害動物包括例如：

鱗翅目昆蟲(鱗翅目(Lepidoptera))，例如小地老虎(*Agrotis ypsilon*)、黃地老虎(*Agrotis segetum*)、棉葉波紋葉蛾(*Alabama argillacea*)、黎豆夜蛾(*Anticarsia gemmatalis*)、蘋實巢蛾(*Argyresthia conjugella*)、丫紋夜蛾(*Autographa gamma*)、松樹尺蠖(*Bupalus piniarius*)、後黃小卷蛾(*Cacoecia*

murinana)、棉褐帶卷蛾(*Capua reticulana*)、尺蠖蛾(*Cheimatobia brumata*)、雲杉卷葉蛾(*Choristoneura fumiferana*)、西方雲杉蚜蟲(*Choristoneura occidentalis*)、美洲黏蟲(*Cirphis unipuncta*)、蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella*)、歐洲松毛蟲(*Dendrolimus pini*)、瓜野螟(*Diaphania nitidalis*)、巨座玉米螟(*Diatraea grandiosella*)、埃及金剛鑽(*Earias insulana*)、小玉米螟(*Elasmopalpus lignosellus*)、葡萄螟蛾(*Eupoecilia ambiguella*)、歐洲松枝蛾(*Evetria bouliana*)、粒膚地老虎(*Feltia subterranea*)、大蠟螟(*Galleria mellonella*)、李小食心蟲(*Grapholitha funebrana*)、梨小食心蟲(*Grapholitha molesta*)、棉鈴蟲(*Heliothis armigera*)、菸芽夜蛾(*Heliothis virescens*)、美洲棉鈴蟲(*Heliothis zea*)、菜螟(*Hellula undalis*)、灰裙尺蠖蛾(*Hibernia defoliaria*)、美國白蛾(*Hyphantria cunea*)、蘋果巢蛾(*Hyponomeuta malinellus*)、番茄蠹蛾(*Keiferia lycopersicella*)、鐵杉尺蠖(*Lambdina fiscellaria*)、甜菜夜蛾(*Laphygma exigua*)、咖啡潛葉蛾(*Leucoptera coffeella*)、旋紋潛葉蛾(*Leucoptera scitella*)、斑點潛葉蛾(*Lithocolletis blancardella*)、葡萄漿果小卷蛾(*Lobesia botrana*)、黃綠條螟(*Loxostege sticticalis*)、舞毒蛾(*Lymantria dispar*)、僧尼毒蛾(*Lymantria monacha*)、窄翅潛葉(*Lyonetia clerkella*)、天幕毛蟲(*Malacosoma neustria*)、甘藍夜蛾(*Mamestra brassicae*)、花旗松毒蛾(*Orgyia pseudotsugata*)、歐洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis*)、冬夜蛾(*Panolis flammea*)、紅鈴蟲(*Pectinophora gossypiella*)、雜

色地老虎(*Peridroma saucia*)、圓掌舟蛾(*Phalera bucephala*)、馬鈴薯塊莖蛾(*Phthorimaea operculella*)、橘細潛蛾(*Phyllocnistis citrella*)、大菜粉蝶(*Pieris brassicae*)、苜蓿綠夜蛾(*Plathypena scabra*)、小菜蛾(*Plutella xylostella*)、大豆夜蛾(*Pseudoplusia includens*)、松梢卷葉蛾(*Rhyacionia frustrana*)、番茄潛葉蛾(*Scrobipalpula absoluta*)、麥蛾(*Sitotroga cerealella*)、葡萄長鬚卷葉蛾(*Sparganothis pilleriana*)、草地黏蟲(*Spodoptera frugiperda*)、灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis*)、斜紋夜蛾(*Spodoptera litura*)、松異帶蛾(*Thaumtopoea pityocampa*)、櫟綠卷葉蛾(*Tortrix viridana*)、粉紋夜蛾(*Trichoplusia ni*)及雲杉小卷葉蛾(*Zeiraphera canadensis*)；

甲蟲類(鞘翅目(*Coleoptera*))，例如梨長吉丁(*Agrilus sinuatus*)、具條叩甲(*Agriotes lineatus*)、黯金針蟲(*Agriotes obscurus*)、六月金龜(*Amphimallus solstitialis*)、穿孔蛀蟲(*Anisandrus dispar*)、棉鈴象甲(*Anthonomus grandis*)、蘋果花象甲(*Anthonomus pomorum*)、線形隱食甲(*Atomaria linearis*)、大松小蠹(*Blastophagus piniperda*)、天幕枯葉蛾(*Blitophaga undata*)、蠶豆象(*Bruchus rufimanus*)、豌豆象(*Bruchus pisorum*)、扁豆象(*Bruchus lentis*)、蘋果卷葉象甲(*Byctiscus betulae*)、甜菜大龜甲(*Cassida nebulosa*)、豆葉甲(*Cerotoma trifurcata*)、甘藍莢象甲(*Ceuthorrhynchus assimilis*)、莖象鼻蟲(*Ceuthorrhynchus napi*)、甜菜脛跳甲(*Chaetocnema tibialis*)、煙草金針蟲

(*Conoderus vespertinus*)、天冬負泥甲(*Crioceris asparagi*)、長角葉甲(*Diabrotica longicornis*)、十二星瓜葉甲(*Diabrotica 12 punctata*)、玉米根葉甲(*Diabrotica virgifera*)、墨西哥豆瓢蟲(*Epilachna varivestis*)、煙草跳甲(*Epitrix hirtipennis*)、棉鑽心蟲(*Eutinobothrus brasiliensis*)、松樹象甲(*Hylobius abietis*)、埃及苜蓿象甲(*Hypera brunneipennis*)、苜蓿葉象甲(*Hypera postica*)、雲杉八齒小蠹(*Ips typographus*)、具條負泥蟲(*Lema bilineata*)、黑角負泥蟲(*Lema melanopus*)、馬鈴薯甲蟲(*Leptinotarsa decemlineata*)、甜菜金針蟲(*Limonius californicus*)、稻象甲(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、棉線蟲(*Melanotus communis*)、油菜露尾甲(*Meligethes aeneus*)、忽布鰓角金龜(*Melolontha hippocastani*)、西方五月鰓金龜(*Melolontha melolontha*)、稻負泥蟲(*Oulema oryzae*)、黑藤象甲(*Ortiorrhynchus sulcatus*)、草莓根象甲(*Otiorrhynchus ovatus*)、辣根猿葉甲(*Phaedon cochleariae*)、油菜藍跳甲(*Phyllotreta chrysocephala*)、金龜子屬(*Phyllophaga* sp.)、庭園麗金龜(*Phyllopertha horticola*)、蕪菁淡足跳甲(*Phyllotreta nemorum*)、黃曲條跳甲(*Phyllotreta striolata*)、日本麗金龜(*Popillia japonica*)、豌豆葉象甲(*Sitona lineatus*)及穀象(*Sitophilus granaria*)；

雙翅類昆蟲(雙翅目(Diptera)，例如埃及伊蚊(*Aedes aegypti*)、刺擾伊蚊(*Aedes vexans*)、墨西哥橘實蠅(*Anastrepha ludens*)、五斑按蚊(*Anopheles maculipennis*)、地中海實蠅(*Ceratitis capitata*)、蛆症金蠅(*Chrysomya*

bezziana)、美洲金蠅(*Chrysomya hominivorax*)、稻金蠅(*Chrysomya macellaria*)、高樑癭蚊(*Contarinia sorghicola*)、盾波蠅(*Cordylobia anthropophaga*)、五帶淡色庫蚊(*Culex pipiens*)、瓜實蠅(*Dacus cucurbitae*)、油橄欖實蠅(*Dacus oleae*)、芸苔莢癭蚊(*Dasineura brassicae*)、黃腹廢蠅(*Fannia canicularis*)、大馬胃蠅(*Gasterophilus intestinalis*)、刺舌蠅(*Glossina morsitans*)、騷擾角蠅(*Haematobia irritans*)、鞍形癭蚊(*Haplodiplosis equestris*)、種蠅(*Hylemyia platura*)、紋皮蠅(*Hypoderma lineata*)、美洲斑潛蠅(*Liriomyza sativae*)、非洲菊斑潛蠅(*Liriomyza trifolii*)、山羊綠蠅(*Lucilia caprina*)、銅綠蠅(*Lucilia cuprina*)、絲光綠蠅(*Lucilia sericata*)、白楊花蠅(*Lycoria pectoralis*)、黑森麥桿蠅(*Mayetiola destructor*)、家蠅(*Musca domestica*)、廢腐蠅(*Muscina stabulans*)、羊鼻蠅(*Oestrus ovis*)、瑞典麥稈蠅(*Oscinella frit*)、甜菜潛葉蠅(*Pegomya hysocyami*)、蔥蠅(*Phorbia antiqua*)、甘藍蠅(*Phorbia brassicae*)、麥蠅(*Phorbia coarctata*)、櫻桃實蠅(*Rhagoletis cerasi*)、蘋果實蠅(*Rhagoletis pomonella*)、牛虻(*Tabanus bovinus*)、普通大蚊(*Tipula oleracea*)及歐洲大蚊(*Tipula paludosa*)；

薊馬類(纓翅目 (*Thysanoptera*))，例如蘭花薊馬(*Dichromothrips corbetti*)、煙草褐薊馬(*Frankliniella fusca*)、苜蓿薊馬(*Frankliniella occidentalis*)、花薊馬(*Frankliniella tritici*)、橘實薊馬(*Scirtothrips citri*)、稻薊馬(*Thrips oryzae*)、南黃薊馬(*Thrips palmi*)及煙薊馬(*Thrips tabaci*)；

膜翅類昆蟲(膜翅目(Hymenoptera))，例如新疆菜葉蜂(*Athalia rosae*)、切葉蟻(*Atta cephalotes*)、南美切葉蟻(*Atta sexdens*)、德州切葉蟻(*Atta texana*)、小長角葉蜂(*Hoplocampa minuta*)、歐洲蘋果長角葉蜂(*Hoplocampa testudinea*)、廚蟻(*Monomorium pharaonis*)、熱帶火蟻(*Solenopsis geminata*)及紅火蟻(*Solenopsis invicta*)；

異翅類昆蟲(異翅目(Heteroptera))，例如喜綠蝽(*Acrosternum hilare*)、多毛長蝽(*Blissus leucopterus*)、煙草黑斑盲蝽(*Cyrtopeltis notatus*)、棉紅蝽(*Dysdercus cingulatus*)、棉蝽(*Dysdercus intermedius*)、麥扁盾蝽(*Eurygaster integriceps*)、棉褐蝽(*Euschistus impictiventris*)、葉足緣蝽(*Leptoglossus phyllopus*)、牧草盲蝽(*Lygus lineolaris*)、牧草盲蝽(*Lygus pratensis*)、稻綠蝽(*Nezara viridula*)、甜菜檢網蝽(*Piesma quadrata*)、麥蝽(*Solubea insularis*)及新熱帶紅背蝽(*Thyanta perditor*)；

同翅類昆蟲(同翅目(Homoptera))，例如驢豆蚜(*Acyrtosiphon onobrychis*)、落葉松球蚜(*Adelges laricis*)、豆瓣蚜(*Aphidula nasturtii*)、蠶豆蚜(*Aphis fabae*)、佛氏蚜(*Aphis forbesi*)、蘋果蚜(*Aphis pomi*)、棉蚜(*Aphis gossypii*)、醋栗蚜(*Aphis grossulariae*)、施氏蚜(*Aphis schneideri*)、繡線菊蚜(*Aphis spiraeicola*)、山茱萸蚜(*Aphis sambuci*)、豌豆蚜(*Acyrtosiphon pisum*)、馬鈴薯長鬚蚜(*Aulacorthum solani*)、銀葉粉虱(*Bemisia argentifolii*)、薊短尾蚜(*Brachycaudus cardui*)、圓尾蚜(*Brachycaudus*

helichrysi)、桃黑短尾蚜(*Brachycaudus persicae*)、梅蚜(*Brachycaudus prunicola*)、甘藍蚜(*Brevicoryne brassicae*)、角釘毛蚜(*Capitophorus horni*)、方翅網蝽(*Cerosipha gossypii*)、草莓毛管蚜(*Chaetosiphon fragaefolii*)、茶蔗隱瘤額蚜(*Cryptomyzus ribis*)、諾曼尼椎球蚜(*Dreyfusia nordmannianae*)、雲杉椎球蚜(*Dreyfusia piceae*)、根瘤蚜(*Dysaphis radicola*)、綠薯蚜(*Dysaulacorthum pseudosolani*)、蘋粉紅劣蚜(*Dysaphis plantaginea*)、梨蚜(*Dysaphis pyri*)、蠶豆微葉蟬(*Empoasca fabae*)、梅大尾蚜(*Hyalopterus pruni*)、茶蔗苦菜蚜(*Hyperomyzus lactucae*)、麥長管蚜(*Macrosiphum avenae*)、大戟長管蚜(*Macrosiphum euphorbiae*)、薔薇長管蚜(*Macrosiphon rosae*)、蠶豆修尾蚜(*Megoura viciae*)、梨蚜(*Melanaphis pyrarius*)、薔薇麥蚜(*Metopolophium dirhodum*)、桃蚜(*Myzodes persicae*)、冬蔥蚜(*Myzus ascalonicus*)、櫻桃黑瘤額蚜(*Myzus cerasi*)、煙蚜(*Myzus persicae*)、變異蚜(*Myzus varians*)、蒿苳蚜(*Nasonovia ribis-nigri*)、褐稻虱(*Nilaparvata lugens*)、囊柄癭綿蚜(*Pemphigus bursarius*)、蔗飛虱(*Perkinsiella saccharicida*)、蛇麻疣額蚜(*Phorodon humuli*)、蘋木虱(*Psylla mali*)、梨木虱(*Psylla pyri*)、冬蔥縊瘤蚜(*Rhopalomyzus ascalonicus*)、玉米縊管蚜(*Rhopalosiphum maidis*)、禾穀縊管蚜(*Rhopalosiphum padi*)、蘋果草縊管蚜(*Rhopalosiphum insertum*)、馬拉圓尾蚜(*Sappaphis mala*)、馬利圓尾蚜(*Sappaphis mali*)、麥二叉蚜(*Schizaphis graminum*)、裂鞘葉蚜(*Schizoneura lanuginosa*)、

麥長管蚜(*Sitobion avenae*)、白背飛虱(*Sogatella furcifera*)、溫室白粉虱(*Trialeurodes vaporariorum*)、大桔蚜(*Toxoptera aurantii*and)及葡萄根瘤蚜(*Viteus vitifolii*)；

白蟻類(等翅目(*Isoptera*))，例如歐洲木白蟻(*Calotermes flavicollis*)、普通白蟻(*Leucotermes flavipes*)、黃胸散白蟻(*Reticulitermes flavipes*)、南歐網紋白蟻(*Reticulitermes lucifugus*)及金花白蟻(*Termes natalensis*)；

直翅類昆蟲(直翅目(*Orthoptera*))，例如家蟋蟀(*Acheta domestica*)、東方非蠪(*Blatta orientalis*)、德國小蠪(*Blattella germanica*)、歐洲球螋(*Forficula auricularia*)、歐洲螻蛄(*Gryllotalpa gryllotalpa*)、飛蝗(*Locusta migratoria*)、雙帶蚱蜢(*Melanoplus bivittatus*)、赤腿蚱蜢(*Melanoplus femur-rubrum*)、墨西哥蚱蜢(*Melanoplus mexicanus*)、遷徙蚱蜢(*Melanoplus sanguinipes*)、落磯山蚱蜢(*Melanoplus spretus*)、紅翅蝗(*Nomadacris septemfasciata*)、美洲大蠪(*Periplaneta americana*)、美洲蚱蜢(*Schistocerca americana*)、沙漠蝗(*Schistocerca peregrina*)、摩洛哥戟紋蝗(*Stauronotus maroccanus*)及溫室蟋蟀(*Tachycines asynamorus*)；

蛛形綱(*Arachnoidea*)，諸如蜘蛛類動物(蜱蟎目(*Acarina*))，例如隱喙蜱科(*Argasidae*)、蜱科(*Ixodidae*)及疥蟎科(*Sarcoptidae*)，諸如美洲花蜱(*Amblyomma americanum*)、彩飾花蜱(*Amblyomma variegatum*)、波斯隱喙蜱(*Argas persicus*)、具環方頭蜱(*Boophilus annulatus*)、無紋牛蜱(*Boophilus decoloratus*)、微小牛蜱(*Boophilus*

microplus)、森林革蜱(*Dermacentor silvarum*)、長蠓璃眼蜱(*Hyalomma truncatum*)、羊硬蜱(*Ixodes ricinus*)、紅硬蜱(*Ixodes rubicundus*)、喙蜱(*Ornithodoros moubata*)、耳殘喙蜱(*Otobius megnini*)、雞皮刺蟎(*Dermanyssus gallinae*)、羊癢蟎(*Psoroptes ovis*)、具尾扇頭蜱(*Rhipicephalus appendiculatus*)、雙寄主壁虱(*Rhipicephalus evertsi*)、疥蟎(*Sarcoptes scabiei*)；及癭蟎屬(*Eriophyidae* spp.)，諸如蘋刺癭蟎(*Aculus schlechtendali*)、橘鏽蟎(*Phyllocoptrata oleivora*)及柑桔癭蟎(*Eriophyes sheldoni*)；跗線蟎屬(*Tarsonemidae* spp.)，諸如仙客來蟎(*Phytonemus pallidus*)及多食跗線蟎(*Polyphagotarsonemus latus*)；細鬚蟎屬(*Tenuipalpidae* spp.)，諸如紫偽葉蟎(*Brevipalpus phoenicis*)；葉蟎屬(*Tetranychidae* spp.)，諸如朱砂葉蟎(*Tetranychus cinnabarinus*)、神澤氏葉蟎(*Tetranychus kanzawai*)、太平洋紅葉蟎(*Tetranychus pacificus*)、棉紅蜘蛛(*Tetranychus telarius*)及棉葉蟎(*Tetranychus urticae*)、蘋果紅蜘蛛(*Panonychus ulmi*)、橘全爪蟎(*Panonychus citri*)及草地小爪蟎(*Oligonychus pratensis*)；

蚤目(*Siphonatera*)，例如印度鼠蚤(*Xenopsylla cheopsis*)、角葉蚤屬(*Ceratophyllus* spp.)。

該等組合物及式(I)化合物、其鹽及其N-氧化物亦適用於防治線蟲類，尤其植物寄生線蟲，諸如根結線蟲類、北方根結線蟲(*Meloidogyne hapla*)、南方根結線蟲(*Meloidogyne incognita*)、爪哇根結線蟲(*Meloidogyne javanica*)及其他根

結線蟲(*Meloidogyne*)種；

胞囊線蟲類，黃金線蟲(*Globodera rostochiensis*)及其他球形胞囊屬(*Globodera*)種；小麥胞囊線蟲(*Heterodera avenae*)、大豆胞囊線蟲(*Heterodera glycines*)、甜菜胞囊線蟲(*Heterodera schachtii*)、三葉草胞囊線蟲(*Heterodera trifolii*)及其他胞囊線蟲屬(*Heterodera*)種；種瘤線蟲類，粒線蟲屬(*Anguina*)種；莖葉線蟲類，滑刃線蟲屬(*Aphelenchoides*)種；螫刺線蟲類，刺線蟲(*Belonolaimus longicaudatus*)及其他刺線蟲屬(*Belonolaimus*)種；松樹線蟲類，松材線蟲(*Bursaphelenchus xylophilus*)及其他傘滑刃屬(*Bursaphelenchus*)種；環形線蟲類，環線蟲屬(*Criconema*)種、環紋線蟲屬(*Criconemella*)種、擬環線蟲屬(*Criconemoides*)種、中環線蟲屬(*Mesocriconema*)種；莖線蟲類，馬鈴薯腐敗線蟲(*Ditylenchus destructor*)、玉米莖線蟲(*Ditylenchus dipsaci*)及其他莖線蟲屬(*Ditylenchus*)種；錐線蟲類，錐線蟲屬(*Dolichodorus*)種；螺旋線蟲，多帶螺旋線蟲(*Helicotylenchus multicinctus*)及其他螺旋線蟲屬(*Helicotylenchus*)種；鞘線蟲類，鞘線蟲屬(*Hemicycliophora*)種及擬鞘線蟲(*Hemicriconemoides*)種；稻根線蟲屬(*Hirshmanniella*)種；矛形線蟲類，冠線蟲屬(*Hoploaimus*)種；假根結線蟲類，假根結線蟲屬(*Nacobbus*)種；針線蟲類，細長針線蟲(*Longidorus elongatus*)及其他長針線蟲屬(*Longidorus*)種；擬墊刃線蟲類，擬墊刃屬(*Paratylenchus*)種；根腐線蟲類，加州根腐

線蟲(*Pratylenchus neglectus*)、北方根腐線蟲(*Pratylenchus penetrans*)、彎曲根腐線蟲(*Pratylenchus curvatus*)、損傷根腐線蟲(*Pratylenchus goodeyi*)及其他根腐線蟲屬(*Pratylenchus*)種；穿孔線蟲類，穿孔線蟲(*Radopholus similis*)及其他穿孔線蟲屬(*Radopholus*)種；腎形線蟲類，旋形線蟲(*Rotylenchus robustus*)及其他盤旋線蟲屬(*Rotylenchus*)種；盾線蟲屬(*Scutellonema*)種；殘根線蟲類，克伯氏殘根線蟲(*Trichodorus primitivus*)及其他殘根線蟲屬(*Trichodorus*)種、擬殘根線蟲屬(*Paratrichodorus*)種；矮化線蟲類，煙草矮化線蟲(*Tylenchorhynchus claytoni*)、不定矮化線蟲(*Tylenchorhynchus dubius*)及其他矮化線蟲屬(*Tylenchorhynchus*)種；柑桔線蟲類，墊刃線蟲屬(*Tylenchulus*)種；劍線蟲類，劍線蟲屬(*Xiphinema*)種；及其他植物寄生線蟲種。

組合物及式(I)化合物、其鹽及其N-氧化物亦適用於防治除人類以外之有害脊椎動物，特別齧齒動物(啮齒目)，包括鼠科(*Muridae*)(特別鼠亞科(*Murinae*))、倉鼠科(*Cricetidae*)及河狸鼠科(*Myocastoridae*)齧齒動物，尤其大鼠屬(*Rattus*)、小鼠屬(*Mus*)、田鼠屬(*Microtus*)、姬鼠屬(*Apodemus*)、水鼠屬(*Arvicola*)及紅背田鼠屬(*Clethrionomys*)齧齒動物，特別以下種：褐家鼠(*Rattus norvegicus*)、黑家鼠(*Rattus rattus*)、銀腹稻鼠(*Rattus argentiventer*)、天涯鼠(*Rattus exulans*)、里氏田鼠(*Mus sp. Arvicola terrestris*)、普通田鼠(*Microtus arvalis*)、草原田鼠(*Microtus pennsylvanicus*)、印度沙鼠

(*Tatera indica*)、白足鼠(*Peromyscus leucopus*)、鹿鼠(*Peromyscus maniculatus*)、南非乳鼠(*Mastomys natalensis*)、棉鼠(*Sigmodon hispidus*)、尼羅壟鼠(*Arvicanthis niloticus*)、小板齒鼠(*Bandicota bengalensis*)、板齒鼠(*Bandicota indica*)、印度地鼠(*Nesokia indica*)、颶風沙鼠(*Meriones hurreinanae*)及柔毛鼠(*Millardia meltada*)。尤其關注大鼠屬及小鼠屬之代表，例如黑家鼠、褐家鼠、小家鼠(*M. musculus*)及海狸鼠(*nutria/Myocastor coypus*)

另外，組合物及式(I)化合物、其鹽及其N-氧化物亦適用於防治除人類及寵物以外之其他有害脊椎動物，例如負鼠目(*didelphimorphia*)之有害脊椎動物，特別是負鼠科，諸如負鼠(*opossums*)(赤狐(*vulpes vulpes*))及美洲負鼠(*American opossums*)(負鼠科)、刷尾負鼠(*brushtail possums*)(帚尾袋貂屬(*Trichosurus*))，特別是普通刷尾負鼠(帚尾袋貂(*Trichosurus vulpecula*))；兔形目(*lagomorpha*)之有害脊椎動物，特別是兔科(*leporidae*)，諸如兔(亦即兔亞科(*Leporinae*)之合適屬)；及浣熊科(*procyonidae*)，諸如浣熊，特別考福浣熊(*Procyon Cofor*)。

因此，本發明亦係關於防治有害脊椎動物、特別有害之齧齒動物之方法，其中在有害脊椎動物之棲息地施用本發明之誘餌調配物。

在本發明之一較佳實施例中，使用式(I)化合物防治昆蟲或蜘蛛類動物，特別鱗翅目、鞘翅目、纓翅目及同翅目之昆蟲及蟬蟬目之蜘蛛類動物。本發明之式(I)化合物尤其適

用於防治繆翅目及同翅目之昆蟲。

式(I)化合物或包含其之殺有害生物組合物可藉由使植物/作物與殺有害生物有效量之式(I)化合物接觸而用以保護生長中之植物及作物免受有害動物、尤其昆蟲、粉蟎科或蜘蛛類動物之侵襲或侵染。術語「作物」係指生長中與已收穫之作物。

式(I)化合物可轉化為常用調配物，例如溶液、乳液、懸浮液、粉塵、散劑、糊狀物及顆粒。使用形式視特定預期目的而定；在各狀況下，應確保本發明之化合物精細且均勻地分布。

調配物係以已知方式製備(欲回顧請參見例如 US 3,060,084；EP-A 707 445(針對液體濃縮物)；Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 1967年12月4日，147-48；Perry's Chemical Engineer's Handbook，第4版，McGraw-Hill, New York, 1963，第8-57頁及其他頁；WO 91/13546；US 4,172,714；US 4,144,050；US 3,920,442；US 5,180,587；US 5,232,701；US 5,208,030；GB 2,095,558；US 3,299,566；Klingman, Weed Control as a Science，John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961；Hance等人，Weed Control Handbook，第8版，Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989及Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Germany), 2001, 2. D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8))，

例如藉由將活性化合物用適於調配農用化學品之助劑增容，該等助劑諸如溶劑(液體載劑)及/或必要時固體載劑、界面活性劑(諸如乳化劑及分散劑)、防腐劑、消泡劑、防凍劑，以及視情況用於種子處理調配物及誘餌調配物之著色劑及/或黏合劑及/或膠凝劑。

合適溶劑之實例為水、芳族溶劑(例如 Solvesso 產品二甲苯)、石蠟(例如礦物油餾份)、醇(例如甲醇、丁醇、戊醇、苯甲醇)、酮(例如環己酮、 γ -丁內酯)、吡咯啉酮(N-甲基吡咯啉酮 [NMP]、N-辛基吡咯啉酮 [NOP])、乙酸酯(二乙酸乙二酯)、二醇、脂肪酸二甲鹽胺、脂肪酸及脂肪酸酯。原則上亦可使用溶劑混合物。

合適之乳化劑特別為非離子及陰離子乳化劑。

分散劑之實例為木質素磺酸鹽、木質素亞硫酸鹽廢液、合成聚合物(諸如聚丙烯酸酯、聚乙烯吡咯啉酮等聚合物)及纖維素衍生物(諸如甲基纖維素)。

合適之界面活化劑包括前述分散劑及乳化劑，諸如木質素磺酸、萘磺酸、苯酚磺酸、二丁基萘磺酸之鹼金屬、鹼土金屬及銨鹽、烷基芳基磺酸鹽、烷基硫酸鹽、烷基磺酸鹽、脂肪醇硫酸鹽、脂肪酸及硫酸化脂肪醇二醇醚，此外包括磺酸化萘及萘衍生物與甲醛之縮合物、磺酸化苯酚與甲醛之縮合物、萘或萘磺酸與苯酚衍生物及甲醛之縮合物、聚乙氧基化苯酚(諸如聚氧化乙烯辛基苯酚醚)、乙氧基化異辛基苯酚、乙氧基化辛基苯酚、乙氧基化壬基苯酚、烷基苯酚聚乙二醇醚、三丁基苯基聚乙二醇醚、三硬

脂醯基苯基聚乙二醇醚(乙氧基化三苯乙烯基苯酚)、烷基芳基聚醚醇、醇及脂肪醇氧化乙烯縮合物、乙氧基化蓖麻油、聚氧化乙烯烷基醚、乙氧基化聚氧化丙烯、月桂醇聚乙二醇醚乙縮醛、山梨糖醇酯、木質素亞硫酸鹽廢液及甲基纖維素。

適於製備可直接噴灑之溶液、乳液、糊狀物或油性分散液之物質為具有中至高沸點之礦物油餾份，諸如煤油或柴油；此外煤焦油及植物或動物來源之油；脂族烴、環烴及芳族烴，例如甲苯、二甲苯、石蠟、四氫萘、烷基化萘或其衍生物；甲醇；乙醇；丙醇；丁醇；環己醇；環己酮；異佛爾酮(isophorone)；強極性溶劑，例如二甲亞砜、N-甲基吡咯啉酮或水。

亦可向調配物中添加防凍劑(諸如甘油、乙二醇、丙二醇)及殺細菌劑(諸如)。

合適之消泡劑為例如以矽或硬脂酸鎂為主之消泡劑。

合適之防腐劑為例如雙氯酚(dichlorophen)。

種子處理調配物可另外包含黏合劑及視情況著色劑。

可添加黏合劑來改良處理後活性物質於種子上之黏著性。合適之黏合劑為嵌段共聚物EO/PO界面活性劑，以及聚乙烯醇、聚乙烯吡咯啉酮、聚丙烯酸酯、聚甲基丙烯酸酯、聚丁烯、聚異丁烯、聚苯乙烯、聚乙烯胺、聚乙烯醯胺(polyethyleneamide)、聚乙烯亞胺(Lupasol[®]、Polymin[®])、聚醚、聚胺基甲酸酯、聚乙酸乙烯酯、甲基纖維素(tylose)及自該等聚合物衍生之共聚物。

調配物中視情況亦可包括著色劑。適於種子處理調配物之著色劑或染料為若丹明 B(Rhodamin B)、C.I. 顏料紅 112、C.I. 溶劑紅 1、顏料藍 15:4、顏料藍 15:3、顏料藍 15:2、顏料藍 15:1、顏料藍 80、顏料黃 1、顏料黃 13、顏料紅 112、顏料紅 48:2、顏料紅 48:1、顏料紅 57:1、顏料紅 53:1、顏料橙 43、顏料橙 34、顏料橙 5、顏料綠 36、顏料綠 7、顏料白 6、顏料棕 25、鹼性紫 10、鹼性紫 49、酸性紅 51、酸性紅 52、酸性紅 14、酸性藍 9、酸性黃 23、鹼性紅 10、鹼性紅 108。

膠凝劑之實例為角叉菜(Satiagel®)。

可藉由將活性物質與固體載劑混合或共同研磨來製備散劑、展布材料及可撒布式產物。

可藉由使活性化合物黏合至固體載劑來製備顆粒，例如經塗布顆粒、經浸漬顆粒及均質顆粒。

固體載劑之實例為礦物土，諸如矽膠、矽酸鹽、滑石、高嶺土、美國活性白土、石灰石、石灰、白堊、紅玄武土、黃土、黏土、白雲石、矽藻土、硫酸鈣、硫酸鎂、氧化鎂、經研磨合成材料、肥料(諸如硫酸銨、磷酸銨、硝酸銨、尿素)及植物來源之產物(諸如穀類粕粉、樹皮粕粉、木粕粉及堅果殼粕粉、纖維素粉末)及其他固體載劑。

調配物通常包含 0.01 至 95 重量%、較佳 0.1 至 90 重量%之活性化合物。在此狀況下，活性化合物係以 90 重量%至 100 重量%、較佳 95 重量%至 100 重量%之純度(根據 NMR 光

譜)使用。

出於種子處理目的，可將各別調配物稀釋2-10倍以使得活性化合物於即用製劑中之濃度達到0.01至60重量%，較佳0.1至40重量%。

式(I)化合物可原樣使用、以其調配物或由其製備之使用形式使用，例如以可直接噴灑之溶液、散劑、懸浮液或分散液、乳液、油性分散液、糊狀物、可撒布式產物、展布物質或顆粒形式藉助於噴灑、霧化、撒布、展布或傾注使用。使用形式完全視預期目的而定；旨在確保本發明之活性化合物在各狀況下之可能最精細分布。

水性使用形式可由乳液濃縮物、糊狀物或可潤濕散劑(可噴灑散劑、油性分散液)藉由添加水製備。為製備乳液、糊狀物或油性分散液，原樣或溶於油或溶劑中之物質可藉助於濕潤劑、增黏劑、分散劑或乳化劑於水中均質化。然而，亦可製備由活性物質、濕潤劑、增黏劑、分散劑或乳化劑及(適當時)溶劑或油組成之濃縮物，且該等濃縮物適於用水稀釋。

即用製劑中之活性化合物濃度可在相對廣之範圍內變化。一般而言，其為0.0001至10重量%，較佳為0.01至1重量%。

活性化合物亦可成功以超低容量方法(ULV)使用，可施用包含逾95重量%之活性化合物之調配物，或甚至可施用無添加劑之活性化合物。

以下為調配物之實例：

1. 經水稀釋供葉面施用之產物。出於種子處理之目的，該等產物可施用於經稀釋或未經稀釋之種子。

A) 水溶性濃縮物(SL、LS)

將10重量份之活性化合物溶解於90重量份之水或水溶性溶劑中。另外，添加濕潤劑或其他助劑。活性化合物經水稀釋後溶解，藉此獲得具有10% (w/w)活性化合物之調配物。

B) 可分散性濃縮物(DC)

經由添加10重量份之分散劑(例如聚乙炔吡咯啉酮)，將20重量份之活性化合物溶解於70重量份之環己酮中。經水稀釋得到分散液，藉此獲得具有20% (w/w)活性化合物之調配物。

C) 可乳化濃縮物(EC)

經由添加十二烷基苯磺酸鈣及蓖麻油乙氧基化物(在各狀況下均為5重量份)，將15重量份之活性化合物溶解於7重量份之二甲苯中。經水稀釋得到乳液，藉此獲得具有15% (w/w)活性化合物之調配物。

D) 乳液(EW、EO、ES)

經由添加十二烷基苯磺酸鈣及蓖麻油乙氧基化物(在各狀況下均為5重量份)，將25重量份之活性化合物溶解於35重量份之二甲苯中。藉助於乳化機(例如Ultraturax)將該混合物引入30重量份之水中且製成均質乳液。經水稀釋得到乳液，藉此獲得具有25% (w/w)活性化合物之調配物。

E) 懸浮液(SC、OD、FS)

在攪動式球磨機中，經由添加10重量份之分散劑、濕潤劑及70重量份之水或有機溶劑，將20重量份之活性化合物磨碎，以得到精細活性化合物懸浮液。經水稀釋得到活性化合物之穩定懸浮液，藉此獲得具有20% (w/w)活性化合物之調配物。

F) 水可分散性顆粒及水溶性顆粒(WG、SG)

經由添加50重量份之分散劑及濕潤劑將50重量份之活性化合物精細研磨，且藉助於技術設備(例如擠壓機、噴霧塔、流化床)製成水可分散性或水溶性顆粒。經水稀釋得到活性化合物之穩定分散液或溶液，藉此獲得具有50% (w/w)活性化合物之調配物。

G) 水可分散性散劑及水溶性散劑(WP、SP、SS、WS)

在轉子-定子型研磨機中，經由添加25重量份之分散劑、濕潤劑及矽膠來研磨75重量份之活性化合物。經水稀釋得到活性化合物之穩定分散液或溶液，藉此獲得具有75% (w/w)活性化合物之調配物。

H) 凝膠調配物(GF)

在攪動式球磨機中，經由添加10重量份之分散劑、1重量份之膠凝劑濕潤劑及70重量份之水或有機溶劑將20重量份活性化合物磨碎，以得到精細活性化合物懸浮液。經水稀釋得到活性化合物之穩定懸浮液，藉此獲得具有20% (w/w)活性化合物之調配物。

2. 不經稀釋供葉面施用之產物。出於種子處理之目的，該等產物可施用於經稀釋或未經稀釋之種子。

I) 可撒布式散劑(DP、DS)

將5重量份之活性化合物精細研磨且與95重量份之細粉狀高嶺土精細混合。由此得到具有5% (w/w)活性化合物之可撒布式產物。

J) 顆粒(GR、FG、GG、MG)

將0.5重量份之活性化合物精細研磨且與95.5重量份之載劑合併，藉此獲得具有0.5% (w/w)活性化合物之調配物。當前方法為擠壓、噴霧乾燥或流化床。由此得到不經稀釋供葉面施用之顆粒。

K) ULV溶液(UL)

將10重量份之活性化合物溶解於90重量份之有機溶劑(例如二甲苯)中。由此得到不經稀釋供葉面施用之具有10% (w/w)活性化合物之產物。

式(I)化合物亦適於處理植物繁殖材料(諸如種子)。習知種子處理調配物包括(例如)可流動濃縮物FS、溶液LS、用於乾燥處理之散劑DS、用於漿液處理之水可分散性散劑WS、水溶性散劑SS及乳液ES及EC及凝膠調配物GF。該等調配物可施用於經稀釋或未經稀釋之種子。可在播種之前直接施用於種子，或在種子發芽後施用於種子。

在一較佳實施例中，使用FS調配物進行種子處理。通常，FS調配物可包含1-800 g/l之活性成分、1-200 g/l界面活性劑、0至200 g/l防凍劑、0至400 g/l之黏合劑、0至200 g/l之顏料及高達1公升之溶劑，較佳為水。

用於種子處理之式(I)化合物之其他較佳FS調配物包含

0.5至80重量%之活性成分、0.05至5重量%之濕潤劑、0.5至15重量%之分散劑、0.1至5%重量之增稠劑、5至20重量%之防凍劑、0.1至2重量%之消泡劑、1至20重量%之顏料及/或染料、0至15重量%之黏附劑/黏著劑、0至75重量%之填充劑/媒劑及0.01至1重量%之防腐劑。

可將不同類型之油、濕潤劑、佐劑、除草劑、殺真菌劑、其他殺有害生物劑或殺細菌劑添加至活性成分中，適當時，在使用之前即刻添加(桶混)。該等藥劑通常以1:10至10:1之重量比與本發明之藥劑混合。

式(I)化合物經由接觸(經由土壤、玻璃、牆壁、蚊帳、地毯、植物部分或動物部分)與攝食(誘餌或植物部分)為有效的。

用於對抗螞蟻、白蟻、黃蜂、蒼蠅、蚊子、蟋蟀或蟑螂時，式(I)化合物較佳以誘餌組合物使用。

誘餌可為液體、固體或半固體製劑(例如凝膠)。固體誘餌可形成為適於各別施用之各種形狀及形式，例如顆粒狀、塊狀、棒狀、盤狀。液體誘餌可填充於例如敞開容器、噴灑裝置、液滴源或蒸發源之各種裝置中以確保適當施用。凝膠可基於水性或油性基質且可在黏性、保水性或老化特徵方面針對特定需要調配。

用於組合物中之誘餌為具有足以刺激諸如螞蟻、白蟻、黃蜂、蒼蠅、蚊子、蟋蟀等或蟑螂之昆蟲食取誘餌之吸引力的產物。吸引力可藉由使用進食刺激劑或性信息素來調控。食物刺激劑係選自(例如)(但不排他)動物及/或植物蛋

白質(肉粕、魚粕或血粕，昆蟲部分，蛋黃)，選自動物來源及/或植物來源之脂肪及油，或單有機醣、寡有機醣或多有機醣，尤其選自蔗糖、乳糖、果糖、右旋糖、葡萄糖、澱粉、果膠或甚至糖蜜或蜂蜜。果實、作物、植物、動物、昆蟲或其特定部分之新鮮或腐爛部分亦可用作進食刺激劑。已知性信息素更具昆蟲特異性。特異性信息素描述於文獻中且為熟習此項技術者所知。

呈氣溶膠(例如於噴霧罐中)、油噴霧劑或泵噴霧劑形式之式(I)化合物之調配物高度適於非專業使用者用於防治諸如蒼蠅、跳蚤、壁虱、蚊子或蟑螂之害蟲。氣溶膠配方較佳由以下各物組成：活性化合物；溶劑，諸如低碳醇(例如甲醇、乙醇、丙醇、丁醇)、酮(例如丙酮、甲基乙基酮)、具有約50°C至250°C之沸點範圍之石蠟烴(例如，煤油)、二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯啉酮、二甲亞砷、芳族烴(諸如甲苯、二甲苯)、水；此外，助劑，諸如乳化劑，諸如山梨糖醇單油酸酯、具有3-7 mol氧化乙烯之油基乙氧基化物、脂肪醇乙氧基化物、香料油(諸如香精油)、中碳脂肪酸與低碳醇形成之酯、芳族羰基化合物；適當時之穩定劑(諸如苯甲酸鈉)、兩性界面活性劑、低碳環氧化物、原甲酸三乙酯；及需要時之推進劑，諸如丙烷、丁烷、氮氣、壓縮空氣、二甲基醚、二氧化碳、氧化亞氮或該等氣體之混合物。

油噴霧劑配方與氣溶膠配方不同之處在於不使用推進劑。

式(I)化合物及其各別組合物亦可用於蚊香及熏香、煙霧筒、汽化器板或長期汽化器中以及防蛀紙、防蛀墊或其它非熱依賴性汽化器系統中。

用式(I)化合物及其各別組合物控制由昆蟲傳播之傳染性疾病(例如瘧疾、登革熱(dengue)及黃熱病、淋巴絲蟲病及利什曼病(leishmaniasis))之方法亦包含處理棚屋及房屋之表面,空氣噴灑及浸漬窗簾、帳篷、衣物用品、蚊帳、捕舌蠅器或其類似物。施用於纖維、織品、針織品、非編織品、編網材料或箔及防水布之殺昆蟲性組合物較佳包含包括殺昆蟲劑、視情況拒避劑及至少一種黏合劑之混合物。合適之拒避劑為(例如)N,N-二乙基-間甲苯醯胺(DEET)、N,N-二乙基苯基乙醯胺(DEPA)、1-(3-環己-1-基-羰基)-2-甲基哌嗪、(2-羥基甲基環己基)乙酸內酯、2-乙基-1,3-己二醇、避蚊酮(indalone)、甲基新癸醯胺(MNDA)、非用於昆蟲防治之擬除蟲菊酯(pyrethroid)(諸如 {(+/-)-3-烯丙基-2-甲基-4-側氧基環戊-2-(+)-烯基-(+)-反-菊酸乙酯(Esbiothrin))、來源於植物提取物或與其相同之拒避劑(如檸檬烯、丁香酚、(+)-優卡醇(Eucamalol)(1)、(-)-1-表優卡醇),或來源於植物之粗植物提取物的拒避劑(如檸檬桉(Eucalyptus maculata)、單葉蔓荊(Vitex rotundifolia)、玫瑰草(Cymbopogon martinii)、檸檬草(Cymbopogon citratus)、香茅(Cymbopogon nardus)。合適之黏合劑係選自(例如)以下各物之聚合物及共聚物:脂族酸之乙烯酯(諸如乙酸乙烯酯及維吾爾酸乙烯酯(vinyl versatate))、醇之

丙烯酸酯及甲基丙烯酸酯(諸如丙烯酸丁脂、丙烯酸2-乙基己基酯及丙烯酸甲酯)、單烯系及二烯系不飽和烴(諸如苯乙烯)，及諸如丁二烯之脂族二烯。

浸漬窗簾及蚊帳通常藉由將織物材料浸入活性式(I)化合物之乳液或分散液中或將乳液或分散液噴灑於帳上來進行。

可用於處理種子之方法原則上為此項技術中已知之所有合適之種子處理技術且尤其種子拌藥技術，諸如種子包衣(例如種子粒化)、種子噴粉及種子吸漲(例如種子浸潤)。本文中，「種子處理」係指使種子與式(I)化合物彼此接觸之所有方法，且「種子拌藥」係指向種子提供一定量之式(I)化合物之種子處理方法，亦即，產生包含式(I)化合物之種子。原則上，可在自種子收穫至種子播種之任何時間對種子施加該處理。可例如使用「播植筒(planter's box)」方法在即將播種種子之前或在種子播種期間處理種子。然而，亦可在種子種植之前數週或數月(例如長達12個月)例如以種子拌藥處理形式進行處理，不會觀察到功效大幅降低之現象。

宜用於處理未播種之種子。如本文中所使用，術語「未播種之種子」意欲包括自種子收穫至為了讓植物發芽及生長之目的而播植種子至土壤中之任何時期的種子。

詳言之，遵循如下處理程序：將原樣或預先經水稀釋後之種子與所要量之種子處理調配物於合適裝置(例如用於固體或固體/液體混合搭配物之混合裝置)中混合，直至組

合物均勻分布於種子上。適當時，之後進行乾燥步驟。

式(I)化合物或其N-氧化物或獸醫學上可接受之鹽亦尤其適用於對抗動物體內及體表之寄生蟲。

因此，本發明之另一目標為提供防治動物體內及體表之寄生蟲之新穎方法。本發明之另一目標為提供用於動物之更安全殺有害生物劑。本發明之另一目標為進一步提供可以比現有殺有害生物劑更降低使用劑量的用於動物之殺有害生物劑。且本發明之另一目標為提供用於動物之殺有害生物劑，其提供對寄生蟲之長效防治。

本發明亦關於含有殺寄生蟲有效量之式(I)化合物或其N-氧化物或獸醫學上可接受之鹽及可接受之載劑，用於對抗動物體內及體表之寄生蟲的組合物。

本發明亦提供處理、防治、預防及保護動物免受寄生蟲侵染及感染之方法，該方法包括由含殺寄生蟲有效量之式(I)化合物或其N-氧化物或獸醫學上可接受之鹽或包含其之組合物經口、局部或非經腸投與或施與動物。

本發明亦提供製備用於處理、防治、預防或保護動物免受寄生蟲侵染或感染之組合物的方法，該組合物包含殺寄生蟲有效量之式(I)化合物或其N-氧化物或獸醫學上可接受之鹽或包含其之組合物。

化合物對抗農業害蟲之活性並不表明其適於防治動物體內及體表的內寄生蟲及外寄生蟲，此需要(例如)低的非催吐性劑量(在經口施用之情況下)、與動物之代謝相容性、低毒性及安全操作性。

已驚人地發現式(I)化合物適於對抗動物體內及體表之內寄生蟲及外寄生蟲。

式(I)化合物或其N-氧化物或其獸醫學上可接受之鹽或包含其之組合物較佳用於防治及預防對包括溫血動物(包括人類)及魚之動物的侵染及感染。其(例如)適於防治及預防對以下各者之侵染及感染：哺乳動物，諸如牛、綿羊、豬(swine)、駱駝、鹿、馬、豬(pig)、家禽、兔、山羊、犬及貓、水牛、驢、黃鹿及馴鹿；以及毛皮動物，諸如貂、栗鼠及浣熊；鳥類，諸如雞、鵝、火雞及鴨；及魚類，諸如淡水魚及咸水魚，諸如鱒魚、鯉魚及鱈魚。

式(I)化合物或其N-氧化物或其獸醫學上可接受之鹽及包含其之組合物較佳用於防治及預防對諸如犬或貓之家養動物之侵染及感染。

對溫血動物及魚之侵染包括(但不限於)虱、咬虱、壁虱、鼻蟲、蟬、咬蠅、蘚蠅、蒼蠅、蠅蛆病蠅幼蟲、恙蟲、蚋、蚊子及跳蚤。

式(I)化合物或其N-氧化物或其獸醫學上可接受之鹽及包含其之組合物適於全身性及/或非全身性防治外寄生蟲及/或內寄生蟲。其具有對抗發育之全部或部分階段之活性。

式(I)化合物尤其適用於對抗外寄生蟲。

式(I)化合物尤其適用於對抗以下目及種之寄生蟲，分別為：

跳蚤類(蚤目(Siphonaptera))，例如貓櫛頭蚤(Ctenocephalides felis)、犬櫛首蚤(Ctenocephalides canis)、印度

鼠蚤 (*Xenopsylla cheopis*)、人蚤 (*Pulex irritans*)、潛蚤 (*Tunga penetrans*)及條紋鼠蚤 (*Nosopsyllus fasciatus*)，

蟑螂類 (蜚蠊目 (*Blattaria-Blattodea*))，例如德國小蠊 (*Blattella germanica*)、亞洲蟑螂 (*Blattella asahinae*)、美洲大蠊 (*Periplaneta americana*)、日本大蠊 (*Periplaneta japonica*)、棕色蜚蠊 (*Periplaneta brunnea*)、黑胸大蠊 (*Periplaneta fuliginosa*)、澳洲蜚蠊 (*Periplaneta australasiae*)及東方蜚蠊 (*Blatta orientalis*)，

蠅類、蚊類 (雙翅目)，例如埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*)、白線伊蚊 (*Aedes albopictus*)、刺擾伊蚊 (*Aedes vexans*)、墨西哥橘實蠅 (*Anastrepha ludens*)、五斑按蚊 (*Anopheles maculipennis*)、十字按蚊 (*Anopheles crucians*)、白足按蚊 (*Anopheles albimanus*)、瘧蚊 (*Anopheles gambiae*)、西部瘧蚊 (*Anopheles freeborni*)、白踝瘧蚊 (*Anopheles leucosphyrus*)、微小瘧蚊 (*Anopheles minimus*)、四紋瘧蚊 (*Anopheles quadrimaculatus*)、紅頭麗蠅 (*Calliphora vicina*)、蛆症金蠅 (*Chrysomya bezziana*)、美洲金蠅 (*Chrysomya hominivorax*)、稻金蠅 (*Chrysomya macellaria*)、鹿蠅 (*Chrysops discalis*)、鹿斑虻 (*Chrysops silacea*)、大西洋斑虻 (*Chrysops atlanticus*)、螺旋蠅 (*Cochliomyia hominivorax*)、盾波蠅 (*Cordylobia anthropophaga*)、氟侖庫蠅 (*Culicoides furens*)、五帶淡色庫蚊 (*Culex pipiens*)、斑蚊 (*Culex nigripalpus*)、熱帶家蚊 (*Culex quinquefasciatus*)、媒斑蚊 (*Culex tarsalis*)、白斑絨蚊 (*Culiseta inornata*)、黑尾絨蚊 (*Culiseta melanura*)、馬蠅

(*Dermatobia hominis*)、黃腹廐蠅(*Fannia canicularis*)、大馬胃蠅(*Gasterophilus intestinalis*)、刺舌蠅(*Glossina morsitans*)、觸舌蠅(*Glossina palpalis*)、毒舌蠅(*Glossina fuscipes*)、鬚舌蠅(*Glossina tachinoides*)、騷擾角蠅(*Haematobia irritans*)、馬鞍形糠蚊(*Haplodiplosis equestris*)、潛蠅屬(*Hippelates* spp.)、紋皮蠅(*Hypoderma lineata*)、山谷黑細蠓(*Leptoconops torrens*)、山羊綠蠅(*Lucilia caprina*)、銅綠蠅(*Lucilia cuprina*)、絲光綠蠅(*Lucilia sericata*)、黑胸葷蚊(*Lycoria pectoralis*)、孟鬆蚊屬(*Mansonia* spp.)、家蠅(*Musca domestica*)、廐腐蠅(*Muscina stabulans*)、羊鼻蠅(*Oestrus ovis*)、銀足白蛉(*Phlebotomus argentipes*)、黑稻田鱗蚊(*Psorophora columbiae*)、褪色鱗蚊(*Psorophora discolor*)、混合蚋(*Prosimulium mixtum*)、紅尾肉蠅(*Sarcophaga haemorrhoidalis*)、肉蠅種(*Sarcophaga* sp.)、吊蘭蚋(*Simulium vittatum*)、刺蠅(*Stomoxys calcitrans*)、牛虻(*Tabanus bovinus*)、黑馬虻(*Tabanus atratus*)、細條馬虻(*Tabanus lineola*)及斑馬虻(*Tabanus similis*)，

虱類(虱目(Phthiraptera))，例如人頭蝨(*Pediculus humanus capitis*)、人體虱(*Pediculus humanus corporis*)、恥陰虱(*Phthirus pubis*)、牛虱(*Haematopinus eurysternus*)、豬虱(*Haematopinus suis*)、牛顎虱(*Linognathus vituli*)、牛鳥虱(*Bovicola bovis*)、雞虱(*Menopon gallinae*)、大雞虱(*Menacanthus stramineus*)及小短鼻牛虱(*Solenopotes capillatus*)。

壁虱類及寄生蟎類(寄蟎目(Parasitiformes))：壁虱類(蜱亞目(Ixodida))，例如肩胛真壁虱(*Ixodes scapularis*)、全環硬蜱(*Ixodes holocyclus*)、太平洋硬蜱(*Ixodes pacificus*)、棕色犬壁虱(*Rhiphicephalus sanguineus*)、安氏落磯山壁虱(*Dermacentor andersoni*)、狗矩頭壁虱(*Dermacentor variabilis*)、美洲花蜱(*Amblyomma americanum*)、墨西哥灣耳扁虱(*Amblyomma maculatum*)、齧齒壁虱(*Ornithodoros hermsi*)、回歸熱壁虱(*Ornithodoros turicata*)及寄生蟎類(中氣門亞目(Mesostigmata))，例如柏氏禽刺蟎(*Ornithonyssus bacoti*)及雞皮刺蟎(*Dermanyssus gallinae*)，

輻蟎亞目(actinedida)(前氣門亞目(Prostigmata))及粉蟎亞目(acaridida)(無氣門亞目(Astigmata))，例如蜂盾蟎屬(*Acarapis* spp.)、姬螯蟎屬(*Cheyletiella* spp.)、鳥扇羽蟎屬(*Ornithocheyletia* spp.)、鼠蟎屬(*Myobia* spp.)、羊癢蟎屬(*Psorergates* spp.)、蠕形蟎屬(*Demodex* spp.)、恙蟎屬(*Trombicula* spp.)、聲蟎屬(*Listrophorus* spp.)、毛囊蟲屬(*Acarus* spp.)、食酪蟎屬(*Tyrophagus* spp.)、嗜木蟎屬(*Caloglyphus* spp.)、粉蟎屬(*Hypodectes* spp.)、翼羽蟎屬(*Pterolichus* spp.)、癢蟎屬(*Psoroptes* spp.)、疥癬屬(*Chorioptes* spp.)、耳疥癬屬(*Otodectes* spp.)、疥蟎屬(*Sarcoptes* spp.)、耳蟎屬(*Notoedres* spp.)、疥癬蟲屬(*Knemidocoptes* spp.)、氣囊蟎屬(*Cytodites* spp.)及皮膜蟎屬(*Laminosioptes* spp.)，

椿象類(半翅目(Heteropterida))：溫帶臭蟲(*Cimex*

lectularius)、熱帶臭蟲(*Cimex hemipterus*)、老年食蟲椿象(*Reduvius senilis*)、錐鼻蟲屬(*Triatoma* spp.)、紅腹獵蝱屬(*Rhodnius* spp.)、錐蝱屬(*Panstrongylus* spp.)及輪形蟲(*Arilus critatus*)，

虱目(*Anoplurida*)，例如血虱屬(*Haematopinus* spp.)、長顎虱屬(*Linognathus* spp.)、虱蝨屬(*Pediculus* spp.)、陰虱屬(*Phthirus* spp.)及管虱屬(*Solenopotes* spp.)，

毛虱目(*Mallophagida*)(粗頸豆象亞目(*Armblycerina*)及肌虱亞目(*Ischnocerina*))，例如毛羽虱屬(*Trimenopon* spp.)、雞虱屬(*Menopon* spp.)、鴨虱屬(*Trinoton* spp.)、牛虱屬(*Bovicola* spp.)、咬虱屬(*Werneckiella* spp.)、綿羊虱屬(*Lepikentron* spp.)、鬃毛虱屬(*Trichodectes* spp.)及貓羽虱屬(*Felicola* spp.)，

蛔蟲線蟲綱(Roundworms Nematoda)：

蛔蟲(Wipeworm)及旋毛蟲類(毛管目(*Trichosyringida*))，例如旋毛蟲科(*Trichinellidae*)(旋毛蟲屬(*Trichinella* spp.))、(鞭蟲科(*Trichuridae*))鞭蟲屬(*Trichuris* spp.)、毛細線蟲屬(*Capillaria* spp.)，

桿形目(*Rhabditida*)，例如桿絲蟲屬(*Rhabditis* spp.)、擬圓蟲屬(*Strongyloides* spp.)、糞類圓線蟲屬(*Helicephalobus* spp.)，

圓蟲科(*Strongylida*)，例如圓蟲屬(*Strongylus* spp.)、鉤蟲屬(*Ancylostoma* spp.)、美洲鉤蟲(*Necator americanus*)、仰口屬(*Bunostomum* spp.)(鉤蟲(Hookworm))、毛樣線蟲屬

(*Trichostrongylus* spp.)、撚轉胃蟲(*Haemonchus contortus*)、牛胃絲蟲屬(*Ostertagia* spp.)、庫柏毛樣線蟲屬(*Cooperia* spp.)、細頸屬(*Nematodirus* spp.)、網尾線蟲屬(*Dictyocaulus* spp.)、杯口線蟲屬(*Cyathostoma* spp.)、結節線蟲屬(*Oesophagostomum* spp.)、腎蟲(*Stephanurus dentatus*)、盤頭線蟲屬(*Ollulanus* spp.)、夏柏特屬(*Chabertia* spp.)、腎蟲(*Stephanurus dentatus*)、氣管開嘴蟲(*Syngamus trachea*)、鉤蟲屬(*Ancylostoma* spp.)、彎口屬(*Uncinaria* spp.)、球首屬(*Globocephalus* spp.)、板口線蟲屬(*Necator* spp.)、豬肺蟲屬(*Metastrongylus* spp.)、毛細苗勒氏肺蟲(*Muellerius capillaris*)、原圓線蟲屬(*Protostrongylus* spp.)、住血線蟲屬(*Angiostrongylus* spp.)、擬馬鹿圓屬(*Parelaphostrongylus* spp.)、貓肺蟲(*Aleurostrongylus abstrusus*)及腎線蟲(*Dioctophyma renale*)，

腸胃蛔蟲類(蛔目(*Ascaridida*))，例如人蛔蟲(*Ascaris lumbricoides*)、豬蛔蟲(*Ascaris suum*)、雞蛔蟲(*Ascaridia galli*)、馬蛔蟲(*Parascaris equorum*)、蟯蟲(*Enterobius vermicularis*)(絲線蟲(*Threadworm*))、犬蛔蟲(*Toxocara canis*)、獅弓蛔蟲(*Toxascaris leonine*)、斯氏尖尾線蟲屬(*Skrjabinema* spp.)及馬蟯蟲(*Oxyuris equi*)，

無唇線蟲目(*Camallanida*)，例如麥地納龍線蟲(*Dracunculus medinensis*)(龍線蟲(*guinea worm*))，

旋尾目(*Spirurida*)，例如眼蟲屬(*Thelazia* spp.)、吳策線蟲屬(*Wuchereria* spp.)、布魯格絲蟲屬(*Brugia* spp.)、蟠尾

絲蟲屬 (*Onchocerca* spp.)、心絲蟲屬 (*Dirofilaria* spp.)、雙瓣絲蟲屬 (*Dipetalonema* spp.)、鬃絲蟲屬 (*Setaria* spp.)、絲絨蟲屬 (*Elaeophora* spp.)、血色食道蟲 (*Spirocerca lupi*) 及馬胃蟲屬 (*Habronema* spp.)，

鉤頭蟲類 (棘頭蟲目 (*Acanthocephala*))，例如棘頭蟲屬 (*Acanthocephalus* spp.)、豬棗頭蟲 (*Macracanthorhynchus hirudinaceus*) 及犬鉤頭蟲屬 (*Oncicola* spp.)，

渦蟲類 (扁蟲 (*Plathelminthes*))：

吸蟲類 (吸蟲綱 (*Trematoda*))，例如肝吸蟲屬 (*Faciola* spp.)、大吸蟲 (*Fascioloides magna*)、並殖吸蟲屬 (*Paragonimus* spp.)、雙腔吸蟲屬 (*Dicrocoelium* spp.)、宇斯基薑片蟲 (*Fasciolopsis buski*)、中華肝吸蟲 (*Clonorchis sinensis*)、住血吸蟲屬 (*Schistosoma* spp.)、毛血吸蟲屬 (*Trichobilharzia* spp.)、有翼翼形吸蟲 (*Alaria alata*)、並殖吸蟲屬 (*Paragonimus* spp.) 及微胞蟲屬 (*Nanocyetes* spp.)，

單殖吸蟲 (*Cercomeromorpha*)，尤其條蟲類 (*Cestoda*)，例如裂頭條蟲屬 (*Diphyllbothrium* spp.)、條蟲屬 (*Tenia* spp.)、胞蟲屬 (*Echinococcus* spp.)、大條蟲 (*Dipylidium caninum*)、多頭條蟲屬 (*Multiceps* spp.)、包膜蟲屬 (*Hymenolepis* spp.)、中殖孔條蟲屬 (*Mesocetoides* spp.)、蝙蝠皮條蟲屬 (*Vampirolepis* spp.)、莫尼茨屬 (*Moniezia* spp.)、裸頭條蟲屬 (*Anoplocephala* spp.)、迭宮條蟲 (*Sirometra* spp.)、裸頭條蟲屬 (*Anoplocephala* spp.) 及包膜蟲屬 (*Hymenolepis* spp.)。

式(I)化合物及含有其之組合物尤其適用於防治雙翅目、蚤目及蜚亞目之害蟲。

此外，使用式(I)化合物及含有其之組合物對抗蚊類尤其較佳。

使用式(I)化合物及含有其之組合物對抗蠅類為本發明之另一較佳實施例。

此外，使用式(I)化合物及含有其之組合物對抗跳蚤類尤其較佳。

使用式(I)化合物及含有其之組合物對抗壁虱類為本發明之另一較佳實施例。

式(I)化合物亦尤其適用於對抗內寄生蟲(蛔蟲線蟲綱、鉤頭蟲類及渦蟲類)。

可進行預防性與治療性的投藥。

活性化合物之投藥係直接進行或以合適製劑形式經口、局部/經皮或非經腸進行。

就經口投與溫血動物而言，式(I)化合物可調配為動物飼料、動物飼料預混物、動物飼料濃縮物、丸劑、溶液、糊狀物、懸浮液、灌服劑、凝膠、錠劑、大丸劑及膠囊。另外，式I化合物可於動物之飲用水中投與動物。就經口投藥而言，所選劑型應向動物提供每天每公斤動物體重0.01 mg至100 mg之式I及式II化合物，較佳每天每公斤動物體重0.5 mg至100 mg之式I及式II化合物。

或者，式(I)化合物可非經腸投與動物，例如經瘤胃內、肌肉內、靜脈內或皮下注射投與。式(I)化合物可分散或溶

解於生理學上可接受之載劑中以用於皮下注射。或者，式(I)化合物可調配為植入物以用於皮下投藥。另外，式(I)化合物可經皮投與動物。就非經腸投藥而言，所選劑型應向動物提供每天每公斤動物體重0.01 mg至100 mg之式(I)化合物。

式(I)化合物亦可以浸液、粉塵、粉末、套環、圓片、噴霧劑、洗髮精、點滴及傾倒調配物之形式及以軟膏或水包油乳液或油包水乳液形式局部施用於動物。就局部施用而言，浸液及噴霧劑通常含有0.5 ppm至5000 ppm且較佳1 ppm至3000 ppm之式(I)化合物。另外，式(I)化合物可調配為用於動物、尤其諸如牛及綿羊之四足動物的耳標。

合適之製劑為：

溶液，諸如口服溶液、稀釋後經口投藥之濃縮物、用於皮膚上或體腔內之溶液、傾注型調配物、凝膠；

用於經口或經皮投藥之乳液及懸浮液；半固體製劑；

其中活性化合物加工於軟膏基質中或水包油乳液或油包水乳液基質中之調配物；

固體製劑，諸如散劑、預混物或濃縮物、顆粒、丸劑、錠劑、大丸劑、膠囊；氣溶膠及吸入劑，及含活性化合物之成形物品。

適於注射之組合物係藉由將活性成分溶解於合適溶劑中且視情況添加諸如酸、鹼、緩衝鹽、防腐劑及增溶劑之其他成分製備。將溶液無菌過濾且無菌填充。

合適之溶劑為生理學上可耐受之溶劑，諸如水；烷醇，

諸如乙醇、丁醇、苯甲醇、甘油、丙二醇、聚乙二醇；N-甲基-吡咯啉酮；2-吡咯啉酮及其混合物。

活性化合物可視情況溶解於適於注射之生理學上可耐受之植物油或合成油中。

合適之增溶劑為促進活性化合物溶解於主溶劑中或防止其沈澱之溶劑。實例為聚乙烯吡咯啉酮、聚乙烯醇、聚氧乙基化蓖麻油及聚氧乙基化脫水山梨糖醇酯。

合適之防腐劑為苯甲醇、三氯丁醇、對羥苯甲酸酯及正丁醇。

口服溶液係直接投與。濃縮物係在預先稀釋至使用濃度後經口投與。口服溶液及濃縮物係根據技術現狀及如上文關於注射溶液所述來製備，無菌程序並非必要的。

用於皮膚上之溶液係滴淋、展布、擦拭、噴撒或噴灑於其上。

用於皮膚上之溶液係根據技術現狀且根據上文關於注射溶液之描述來製備，無菌程序並非必要的。

其他合適之溶劑為聚丙二醇；苯乙醇；苯氧基乙醇；酯，諸如乙酸乙酯或乙酸丁酯、苯甲酸苯甲酯；醚，諸如烷二醇烷基醚(例如二丙二醇單甲醚)；酮，諸如丙酮、甲基乙基酮；芳族烴；植物油及合成油；二甲基甲醯胺；二甲基乙醯胺；二乙二醇單乙醚(transcutol)；甘油醇縮丙酮(solktal)；碳酸丙二酯及其混合物。

在製備期間添加增稠劑可為有利的。合適之增稠劑為無機增稠劑，諸如膨潤土、膠狀矽酸、單硬脂酸鋁；有機增

稠劑，諸如纖維素衍生物、聚乙烯醇及其共聚物、丙烯酸酯及甲基丙烯酸酯。

凝膠係塗覆於或展布於皮膚上或引入體腔中。凝膠係藉由用足夠增稠劑處理如在注射溶液之情況下所述製備之溶液來製備，該增稠劑由具有類似軟膏稠度之透明物質所形成。所使用之增稠劑為上文所列之增稠劑。

傾注型調配物係傾注或噴灑於皮膚之限定區域上，活性化合物滲透皮膚且在全身起作用。

傾注型調配物係藉由將活性化合物溶解、懸浮或乳化於合適之皮膚相容性溶劑或溶劑混合物中製備。適當時，添加其他助劑，諸如著色劑、生物吸收促進物質、抗氧化劑、光穩定劑、黏著劑。

合適之溶劑為：水；烷醇；二醇；聚乙二醇；聚丙二醇；甘油；芳醇，諸如苯甲醇、苯乙醇、苯氧基乙醇；酯，諸如乙酸乙酯、乙酸丁酯、苯甲酸苯甲酯；醚，諸如烷二醇烷基醚(諸如二丙二醇單甲醚、二乙二醇單丁醚)；酮，諸如丙酮、甲基乙基酮；環狀碳酸酯，諸如碳酸丙二酯、碳酸乙二酯；芳族及/或脂族烴；植物油或合成油；DMF；二甲基乙醯胺；正烷基吡咯啉酮，諸如甲基吡咯啉酮、正丁基吡咯啉酮或正辛基吡咯啉酮；N-甲基吡咯啉酮；2-吡咯啉酮；2,2-二甲基-4-氧基-亞甲基-1,3-二氧戊環及甘油縮甲醛。

合適之著色劑為允許用於動物且可溶解或懸浮之所有著色劑。

合適之吸收促進物質為(例如)DMSO；展布油劑，諸如十四烷酸異丙酯、二丙二醇壬酸酯、聚矽氧油及其與聚醚之共聚物、脂肪酸酯、甘油三酯、脂肪醇。

合適之抗氧化劑為亞硫酸鹽或焦亞硫酸鹽(諸如焦亞硫酸鉀)、抗壞血酸、丁基羥基甲苯、丁基羥基苯甲醚、生育酚。

合適之光穩定劑為(例如)2-苯基苯并咪唑-5-磺酸(novantisolic acid)。

合適之黏著劑為(例如)纖維素衍生物、澱粉衍生物、聚丙烯酸酯、天然聚合物，諸如海藻酸酯、明膠。

乳液可經口、經皮投與或以注射液形式投與。

乳液為油包水型或為水包油型。

其係藉由將活性化合物溶解於疏水相中或溶解於親水相中且藉助於合適乳化劑及(適當時)其他助劑(諸如著色劑、吸收促進物質、防腐劑、抗氧化劑、光穩定劑、黏度增強物質)使其與其他相溶劑均質化而製備。

合適之疏水相(油)為：

液態石蠟；聚矽氧油；天然植物油，諸如芝麻油、杏仁油、蓖麻油；合成甘油三酯，諸如與鏈長 C_8 - C_{12} 之植物脂肪酸或其他特殊選定之天然脂肪酸形成之辛酸/癸酸甘油二酯、甘油三酯混合物；可能亦含有羥基之飽和或不飽和脂肪酸的偏甘油酯混合物； C_8 - C_{10} 脂肪酸之甘油單酯及甘油二酯；脂肪酸酯，諸如硬脂酸乙酯、己二酸二-正丁酯、月桂酸己酯、二丙二醇壬酸酯；具有中等鏈長之支鏈

脂肪酸與鏈長 C_{16} - C_{18} 之飽和脂肪醇形成之酯；十四烷酸異丙酯；棕櫚酸異丙酯；鏈長 C_{12} - C_{18} 之飽和脂肪醇之辛酸酯/癸酸酯；硬脂酸異丙酯；油醇油酸酯；油酸癸酯；油酸乙酯；乳酸乙酯；蠟狀脂肪酸酯，諸如合成鴨尾脂腺脂肪、鄰苯二甲酸二丁酯、己二酸二異丙酯及與後者相關之酯混合物；脂肪醇，諸如異十三烷醇、2-辛基十二烷醇、十六烷基硬脂醇(cetylstearyl alcohol)、油醇；及脂肪酸，諸如油酸；及其混合物。

合適之親水相為：水；醇，諸如丙二醇、甘油、山梨糖醇及其混合物。

合適之乳化劑為：非離子型界面活性劑，例如聚乙氧基化蓖麻油、聚乙氧基化脫水山梨糖醇單油酸酯、脫水山梨醇單硬脂酸酯、單硬脂酸甘油酯、單硬脂酸聚氧乙酯、烷基苯酚聚乙二醇醚；兩性界面活性劑，諸如N-月桂基-對亞胺基二丙酸二鈉或卵磷脂；陰離子型界面活性劑，諸如月桂基硫酸鈉、脂肪醇醚硫酸酯、單/二烷基聚乙二醇醚正磷酸酯單乙醇胺鹽；陽離子活性界面活性劑，諸如氯化十六烷基三甲基銨。

合適之其他助劑為：增強黏度且穩定乳液之物質，諸如羧甲基纖維素、甲基纖維素及其他纖維素及澱粉衍生物、聚丙烯酸酯、海藻酸酯、明膠、阿拉伯膠(gum arabic)、聚乙炔吡咯啉酮、聚乙炔醇、甲基乙炔基醚與順丁烯二酸酐之共聚物、聚乙二醇、蠟、膠狀矽酸或所提及物質之混合物。

懸浮液可經口或局部/經皮投與。其係藉由將活性化合物懸浮於懸浮劑中、適當時經由添加諸如濕潤劑、著色劑、生物吸收促進物質、防腐劑、抗氧化劑、光穩定劑之其他助劑來製備。

液體懸浮劑為所有均質溶劑及溶劑混合物。

合適之濕潤劑(分散劑)為上文所列之乳化劑。

可提及之其他助劑為上文所列之彼等助劑。

半固體製劑可經口或局部/經皮投與。其與上述懸浮液及乳液不同之處僅在於其更高之黏度。

製備固體製劑時，將活性化合物與合適之賦形劑混合(適當時經由添加助劑)且使其達成所要形式。

合適之賦形劑為生理學上可耐受之所有固體惰性物質。所用彼等物質為無機或有機物質。無機物質為(例如)氯化鈉、碳酸鹽(諸如碳酸鈣)、碳酸氫鹽、氧化鋁、氧化鈦、矽酸、黏土、沈澱矽石或膠狀矽石或磷酸鹽。有機物質為(例如)糖、纖維素、食物及飼料(諸如奶粉、動物粕粉、穀粕粉及穀屑)、澱粉。

合適之助劑為上文已提及之防腐劑、抗氧化劑及/或著色劑。

其他合適之助劑為潤滑劑及助流劑，諸如硬脂酸鎂、硬脂酸、滑石、膨潤土；崩解促進物質，諸如澱粉或交聯聚乙烯吡咯啉酮；黏合劑，諸如澱粉、明膠或線性聚乙烯吡咯啉酮；及無水黏合劑，諸如微晶纖維素。

一般而言，「殺寄生蟲有效量」意謂對生長達成可觀察

之效應所需之活性成分之量，所述效應包括壞死、死亡、延遲、防止及移除、破壞或以其他方式減少目標生物體之出現及活性之效應。本發明所使用之各種化合物/組合物之殺寄生蟲有效量可變化。殺寄生蟲有效量之組合物亦將根據主要條件(諸如所要殺寄生蟲效應及持續時間、目標物種、施用模式及其類似條件)而變化。

可用於本發明之組合物通常可包含約0.001%至95%之式(I)化合物。

通常，以每天0.5 mg/kg至100 mg/kg、較佳每天1 mg/kg至50 mg/kg之總量施用式(I)化合物有利。

即用製劑含有10 ppm至80重量%、較佳0.1重量%至65重量%、更佳1重量%至50重量%、最佳5重量%至40重量%之濃度、作用於寄生蟲、較佳外寄生蟲的化合物。

使用前稀釋之製劑含有0.5重量%至90重量%、較佳1重量%至50重量%之濃度、作用於外寄生蟲之化合物。

此外，製劑包含10 ppm至2重量%、較佳0.05重量%至0.9重量%、尤其較佳0.005重量%至0.25重量%之濃度、對抗內寄生蟲的式(I)化合物。

在本發明之一較佳實施例中，包含式(I)化合物之組合物係經皮/局部施用。

在另一較佳實施例中，局部施用係以含有化合物之成形物品形式(諸如套環、圓片、耳標、固定於身體部分上之條帶及黏著條及箔)進行。

通常，施用在3週期間以每公斤所治療動物體重10 mg至

300 mg、較佳20 mg至200 mg、最佳25 mg至160 mg之總量釋放式(I)化合物之固體調配物有利。

製備成形物品時，使用熱塑性及可撓性塑膠以及彈性體及熱塑性彈性體。合適之塑膠及彈性體為與式(I)化合物充分相容之聚乙烯樹脂、聚胺基甲酸酯、聚丙烯酸酯、環氧樹脂、纖維素、纖維素衍生物、聚醯胺及聚酯。塑膠及彈性體之詳細清單以及成形物品之製備程序列於(例如)WO 03/086075中。

可施用之對抗齧齒動物及其他有害脊椎動物之本發明組合物特別包括誘餌調配物以及種子處理調配物，因為經處理種子本身可充當誘餌。

除至少一種式(I)化合物、其鹽或N-氧化物外，誘餌調配物亦包括至少一種誘餌材料及視情況其他成分，諸如引誘劑、鎮痛劑、殺生物劑、佐劑及/或常用於誘餌調配物之其他調配添加劑。合適誘餌調配物主要描述於例如DE 2506769、EP 317260、US 4,190,734、GB 1053088、GB 1274442、DE 4444261、WO 98/04129、WO 01/80645、WO 2003/094612、WO 2007/057393、WO 2007/031796及WO 2009/047175等文獻及其中引用之文獻中。

以調配物之總重量計，式(I)化合物、其鹽或N-氧化物之總量通常在0.001重量%至50重量%範圍內，其餘部分包括至少一種誘餌材料及視情況如本文中所提及之其他成分。

常用誘餌材料為植物或動物食物及飼料。合適實例為粗穀物粕粉、穀粒、穀物片或穀物粕粉(例如燕麥、小麥、

大麥、玉蜀黍、大豆、稻米之穀物片或穀物粕粉)、椰片、經研磨之椰子、糖漿(例如藉由使澱粉水解所獲得(葡萄糖漿)、轉化糖糖漿、甜菜糖糖漿、槭糖漿)、糖(例如蔗糖、乳糖、果糖、葡萄糖)、經磨碎之堅果、經研磨之堅果(例如榛子、核桃、杏仁)、植物脂/油(例如菜籽油、大豆脂、向日葵油、可可油、花生油、花生醬、玉米油)、動物脂/油(黃油、豬油、魚油)、蛋白質(例如脫脂乳粉、蛋粉、蛋白質水解物)及礦物質(例如食鹽)。

較佳為植物食品，諸如燕麥粉、燕麥片、小麥核、粗小麥粕粉、小麥麵粉、玉米粕粉、椰片、經研磨之椰子、葡萄糖漿、槭糖漿、甜菜糖糖漿、蔗糖、葡萄糖、經研磨之榛子、經研磨之核桃、杏仁、菜籽油、大豆脂、花生油、玉米油；動物脂，諸如黃油；蛋白質，諸如蛋粉及脫脂乳粉。

尤其較佳為植物食品，諸如燕麥粉、玉米粕粉、椰片、經研磨之椰子、葡萄糖漿、槭糖漿、蔗糖、經研磨之榛子、大豆脂、花生油、花生醬及蛋白質，諸如脫脂乳粉。

出於本發明之目的，引誘劑作為誘食劑或以另一方式、特別經由氣味(例如性引誘劑)吸引有害之嚙齒動物關注本身並非飼料之誘餌的物質(或物質混合物)。引誘劑之實例為信息素、酵母、經研磨之甲殼類動物、糞便物、漿果、巧克力、魚粕粉、肉、黑胡椒及增味劑，諸如麩胺酸，特別麩胺酸鈉及麩胺酸二鈉。

調配物中誘餌材料之量可視調配物類型而不同。以調配

物之重量計，誘餌材料之量通常在1重量%至99.99重量%範圍內。

殺菌劑之實例包括噻唑啉酮，諸如 Proxel[®](來自 ICI)或 Acticide[®] RS(來自 Thor Chemie)、Kathon[®] MK(來自 Rohm & Haas)及 Dowicil[®](來自 Dow Elanco)。

鎮痛劑包括止痛劑及鎮靜劑以及止痛劑與鎮靜劑之混合物。止痛劑之實例包括嗎啡(morphine)、可待因(codeine)、雙氫可待因(dihydrocodeine)、氫嗎啡(hydromorphone)、羥考酮(oxycodone)、哌替啶(pethidine)、曲馬多(tramadol)、美沙酮(methadone)、乙醯水楊酸、二氟尼柳(diflunisal)、萘普生(naproxen)、吡羅昔康(proxicam)、替諾昔康(tenoxicam)、美儂西康(meloxicam)、撲熱息痛(paracetamol)及安替比林(phenazone)。鎮靜劑之實例包括丙泊酚(propofol)、可樂定(clonidine)、諸如苯巴比妥(phenobarbital)及戊巴比妥(pentobarbital)之巴比妥酸鹽(barbiturate)及苯并二氮呋，特別在抗焦慮藥中提及之鎮靜劑。止痛劑與鎮靜劑之混合物之實例為包含一或多種選自由以下各劑組成之群的止痛劑：嗎啡、可待因、雙氫可待因、氫嗎啡、羥考酮、哌替啶、曲馬多、美沙酮、乙醯水楊酸、二氟尼柳、萘普生、吡羅昔康、替諾昔康、美儂西康、撲熱息痛及安替比林，與一或多種選自由以下各劑組成之群之鎮靜劑的混合物：丙泊酚、可樂定、苯巴比妥、戊巴比妥、阿普唑侖(alprazolam)、溴西洋(bromazepam)、溴替唑侖(brotizolam)、氯二氮環氧化物(chlordiazepoxide)、氯巴占(clobazam)、

氯硝西泮(clonazepam)、地西泮(diazepam)、氯氮平酸鹽(clorazepate)、氟硝西泮(flunitrazepam)、氟西泮(flurazepam)、氯普唑倫(loprazolam)、勞拉西泮(lorazepam)、氯甲西泮(lormetazepam)、美達西泮(medazepam)、咪達唑倫(midazolam)、硝西泮(nitrazepam)、去甲西泮(nordazepam)、奧沙西泮(oxazepam)、普拉西泮(prazepam)、替馬西泮(temazepam)、四氫西泮(tetrazepam)及三唑倫(triazolam)。

其他常用調配添加劑包含著色劑、苦味劑、助流劑、黏合劑、改良耐候性之試劑及抗氧化劑。

通常添加著色劑，且藉此明顯標示誘餌調配物不可食用以免由人類或非目標動物誤食。藍色著色劑特別用於威懾禽類。然而，其亦可用於偵測消耗於有害之齧齒動物糞便或嘔吐物中之誘餌。

苦味劑用於避免人類偶然食用。尤其較佳為苯甲酸變性托寧(denatonium benzoate)，其在合適濃度(通常1至200 ppm，特別5至20 ppm)時具有令人極不愉快、但對齧齒動物而言則不然之味道。

視誘餌調配物類型而定添加助流劑及黏合劑。黏合劑能夠使本發明之混合物固著於誘餌組分(例如穀粒)之表面上或(在例如糊狀物之狀況下)賦予結構及黏著性。諸如礦物質土及鋁矽酸鹽之助流劑有助於擠出，且因此其常用於球粒及擠出塊中。

改良耐候性之合適試劑例如為石蠟。

合適抗氧化劑之實例為較佳10 ppm至20 000 ppm之量之

第三丁基氫醌(TBHQ)、丁基化羥基甲苯及丁基化羥基苯甲醚。

較佳誘餌調配物為食物誘餌，特別種子穀物誘餌及合適處理劑、球粒(模成形物品)、塗蠟球粒、熔融蠟塊、經壓縮或擠出之蠟塊、糊狀物、凝膠、顆粒及發泡體。

饋料誘餌通常由可以不同精細形式、例如以細粒或以經更精細或欠精細研磨之粕粉形式存在的穀物組成。

呈粕粉形式之誘餌之優點在於其難以被動物運走及儲存，但不易處理(粉塵)且快速變質。

完整細粒之缺點在於其亦會被非目標動物(例如禽類)而且在某些情況下會被人類攝入。

可將本發明之化合物及視情況其他佐劑(特別與黏合劑結合)塗覆於飼料表面。因此，較佳用本發明之至少一種化合物以種子處理方式處理該等飼料。因此，類似於WO 2007/057393，處理種子以製備基於種子之誘餌的合適調配物可包含：

- (a) 式(I)之至少一種化合物或其鹽或N-氧化物，其視情況與至少一種疼痛抑制劑合併；
- (b) 至少一種多元醇；
- (c) 黏著劑，及適當時
- (d) 單糖及/或二糖及/或寡糖。

在該等組合物中，以組合物之重量計，多元醇含量可為1重量%至50重量%，較佳1重量%至20重量%。

以組合物之重量計，黏著劑含量可為1重量%至30重量

%，較佳1重量%至10重量%，尤其較佳1重量%至5重量%。

以組合物之重量計，單醣及/或二醣及/或寡醣含量可為10重量%至50.0重量%，較佳10.0重量%至35.0重量%，尤其較佳15.0重量%至25.0重量%。

合適多元醇包括乙二醇、聚乙二醇、甘油、丙二醇、二丙二醇，較佳甘油。

作為組分c)，較佳為單醣及二醣。使用二醣極其較佳。合適單醣為葡萄糖、果糖、半乳糖，較佳果糖。合適二醣為蔗糖、麥芽糖、乳糖，較佳蔗糖(例如純形式或糖蜜、甜菜糖形式)。合適寡醣為澱粉。

合適黏著劑為氧化乙烯/氧化丙烯共聚物；聚乙烯醇(例如 Mowiol[®] 4-98, Clariant；Rhodoviol[®] 60-20, Rhone-Poulence)；聚乙烯吡咯啉酮(Sokalan[®] HP 50, BASF；Kollidon[®] 25, BASF；Luvitec[®] K80, BASF；Agrimer[®] A, ISP Global Techn)；聚丙烯酸酯(例如 Sokalan[®] PA 110 S, BASF)；聚甲基丙烯酸甲酯；水溶性聚烯烴衍生物，諸如聚丁烯衍生物、聚氧化乙烯(例如聚醚)或聚異丁基衍生物(例如聚烯烴與順丁烯二酸酐衍生物之共聚物(例如 Densodrin BA[®], BASF))；聚苯乙烯衍生物(例如苯乙烯與順丁烯二酸酐衍生物之共聚物或苯乙烯與丙烯酸衍生物之共聚物或苯乙烯/丁二烯基乳膠共聚物，可以例如名稱 Semkote E-125 獲得於 Uniqema)及聚乙烯胺；聚乙烯鹽胺；聚(乙烯亞胺)(例如 Lupasol[®], BASF；Polymin[®], BASF)；聚胺基甲酸酯(Semkote E-105,

Uniqema)；聚乙酸乙烯酯、甲基纖維素及聚乙烯蠟(例如以名稱Poligen[®] WE 7市購於BASF)，較佳為氧化乙烯/氧化丙烯共聚物；聚丙烯酸酯(例如 Sokalan[®] PA 110 S, BASF)；聚甲基丙烯酸甲酯；水溶性聚烯烴衍生物，諸如聚丁烯衍生物、聚氧化乙烯(例如聚醚)或聚異丁基衍生物(例如聚烯烴與順丁烯二酸酐衍生物之共聚物(例如 Densodrin BA[®], BASF))；聚苯乙烯衍生物(例如苯乙烯與順丁烯二酸酐衍生物之共聚物或苯乙烯與丙烯酸衍生物之共聚物或苯乙烯/丁二烯基乳膠共聚物，可例如以名稱 Semkote E-125獲得於Uniqema)；聚乙酰胺；聚乙烯醯胺；聚(乙烯亞胺)(例如Lupasol[®], BASF；Polymin[®], BASF)；聚胺基甲酸酯(Semkote E-105, Uniqema)、聚乙酸乙烯酯及聚乙烯蠟(例如以名稱Poligen[®] WE 7市購於BASF)，尤其較佳為氧化乙烯/氧化丙烯共聚物；聚丙烯酸酯(例如 Sokalan[®] PA 110 S, BASF)；聚甲基丙烯酸甲酯；聚苯乙烯衍生物(例如苯乙烯與順丁烯二酸酐衍生物之共聚物或苯乙烯與丙烯酸衍生物之共聚物或苯乙烯/丁二烯基乳膠共聚物，可例如以名稱 Semkote E-125獲得於Uniqema)及聚乙烯蠟(例如以名稱Poligen[®] WE 7市購於BASF)。

此外，本發明之誘餌調配物可視情況包含其他佐劑，諸如如上所提及之界面活性劑(諸如潤濕劑、黏著劑及分散劑)、消泡劑、增稠劑及著色劑。

可藉由熟習此項技術者已知之方法進行處理(例如用本發明之調配物噴灑穀粒或將穀粒浸入/培育於本發明之調

配物中，適當時使用諸如連續或逐批操作式種子拌藥器之合適裝置)。其中，調配物較佳可用至多每公斤穀粒 7.5 g 水稀釋。視情況可將經處理之穀粒乾燥。

此外，所謂的球粒(模成形物品)作為誘餌調配物較佳。該等球粒包含本發明之式(I)化合物、(I)之鹽或N-氧化物與視情況粉末狀或經研磨之飼料(B)(特別穀物及增稠劑)及其他調配添加劑(C)之混合物。通常藉由壓縮、擠出及隨後乾燥來製備球粒。

球粒尺寸視目標動物而變化。通常，小球以直徑為3至5 mm 且長度為5至10 mm之圓筒形式製備。

本發明化合物之含量通常為球粒之0.001重量%至30重量%。

為增加球粒耐候性，本發明之一實施例中添加石蠟，然而降低球粒對有害之嚙齒動物之可口性。

另一較佳誘餌調配物為蠟塊體調配物，除式(I)之至少一種化合物或其鹽或N-氧化物外，其亦含有飼料(通常穀粒、粗穀物粕粉或穀物粉末)(B)、適當時調配添加劑(C)及石蠟之混合物。蠟塊體調配物之優點在於其耐候性良好；然而以對有害之嚙齒動物之可口性為代價。蠟塊體調配物通常藉由澆鑄、擠出或壓縮法製備，最後提及之方法中之蠟含量較低，其在具有類似良好的耐候性之情況下使可口性增加。蠟塊體調配物可製備成允許其可例如懸掛或固定於誘餌台上之多種形狀。在一較佳實施例中，蠟塊體包含多個轉角，因為動物更喜歡啃轉角。

另一較佳誘餌調配物為顆粒，除式(I)之至少一種化合物、其鹽或N-氧化物外，其亦包含通常經粉碎(例如經研磨)之飼料(R)及適當時其他添加劑及黏合劑。顆粒之製備描述於例如EP-A 0 771 393中。

另一較佳誘餌調配物為凝膠(參見，例如WO 03/094612及其中引用之參考文獻)。該等凝膠較佳包含

- 作為分散劑之水；
- 至少一種增稠劑；
- 本發明之至少一種化合物；
- 一或多種飼料。

在一較佳實施例中，凝膠另外包含一或多種以下組分：

- 鹼；
- 保濕劑；
- 氧化穩定劑；
- 著色劑；
- 苦味劑；
- 其他添加劑。

所用增稠劑為有機及無機大分子。可提及之有機大分子為纖維素衍生物，例如羥丙基纖維素、羥乙基纖維素、甲基纖維素、羧甲基纖維素鈉、羥丙基甲基纖維素、羥乙基甲基纖維素、羥乙基丙基纖維素，諸如三仙膠、海藻酸鹽、角叉菜膠、瓊脂、聚乙烯醇、聚乙烯吡咯啉酮、聚丙烯酸及聚甲基丙烯酸。可提及之無機大分子(無機成凝膠劑)為高分散矽石及膨土(例如Rudolf Voigt, Pharmazeutische

Technologie [Pharmaceutical technology] , 第 362 至 385 頁 , Ulstein Mosby)。

所用鹼為例如鹼金屬氫氧化物、鹼土金屬氫氧化物及胺基衍生物，諸如氫氧化鉀、氫氧化鈉、三乙醇胺或氫氧化銨溶液。鹼可用於調整pH值。

所用保濕劑為例如多元醇，諸如甘油、丙二醇、乙二醇、糖醇及聚丙二醇。保濕劑防止凝膠乾燥以使其由齧齒動物服用時保留彈性且不散。較佳保濕劑為甘油、丙二醇、聚丙二醇200、丙二醇300、聚丙二醇400、山梨醇、甘露醇及木糖醇。

可提及之氧化穩定劑為丁基羥基甲苯、丁基羥基甲氧苯、生育酚(例如維生素E)或抗壞血酸及其衍生物(例如抗壞血酸棕櫚酸酯、抗壞血酸鈉)。可藉由添加氧化穩定劑使食品及飼料穩定。尤其較佳為丁基羥基甲苯、維生素E、抗壞血酸。

可提及之著色劑為藍色、綠色及紅色顏料及藍色、綠色及紅色可溶性染料(參見Colour Index，第4版：Hue blue, red, green)，其中藍色著色劑用於威懾禽類較佳。本發明之凝膠可藉由著色劑著色以用於警告目的。

亦獲准用於著色化妝品之合適著色劑較佳(參看，例如Otterstätter, Die Färbung von Lebensmitteln, Arzneimitteln, Kosmetika [Coloring foodstuffs, pharmaceuticals, cosmetics], Behr's Verlag，第2版，第52至57頁)。較佳使用顏料作為著色劑。

可使用之添加劑為例如苦味劑(諸如苯甲酸變性托甯)及

天然及合成香料(參見，例如 Hamann & Reimer, Holzminden 之產品清單)。

另一較佳類型之誘餌調配物為高穩固性發泡體或可撓性發泡體，較佳可撓性發泡體。根據本發明可使用之高穩固性發泡體描述於例如 FR-PS 2 676 888 及 US 4,190,734 中。根據本發明可使用之可撓性發泡體描述於例如 GB-PS 1 053 088 及 GB 1 274 442 中。

較佳發泡體為 DE-A 44 44 261 中描述之可撓性發泡體。該等可撓性發泡體包含：

- 本發明之至少一種化合物；
- 至少一種親水性聚合物，其平均分子量為 2000 至 60000(藉由凝膠滲透層析法(GPC)測定)，其較佳選自長鏈聚胺基甲酸酯、聚酯、聚酯多元醇、聚苯乙烯、聚丁二烯、順丁烯二酸聚合物之系列，其各自在聚合物鏈中經羧基及/或胺基修飾；
- 長鏈脂族 C₆-C₂₂ 脂肪酸，諸如棕櫚酸、十二烷酸及硬脂酸或其鹼金屬鹽、鹼土金屬鹽及銨鹽；
- 及適當時選自由著色劑、乳化劑、溶劑、引誘劑及飼料組成之系列之其他佐劑。

作為用於油漆之黏合劑之親水性聚合物在此項技術中已知且描述於例如 H. Kittel, Lehrbuch der Lacke und Beschichtungen [Textbook of paints and coatings]，第 IV 卷，第 76 至 306 頁，Verlag W.A. Colomb (1096) 或該教科書，(1976) 版本，第 IV 卷第 328 至 358 頁中。

可用於可撓性發泡體中之親水性聚合物為物理乾燥黏合劑，例如其黏合劑係以(i)聚酯多元醇、(ii)增鏈劑、(iii)二異氰酸酯及(iv)羥基羧酸之經完全反應之線性聚胺基甲酸酯為主之親水性聚合物。製備該等聚胺基甲酸酯之合適聚酯多元醇(i)為例如己二酸、烷二醇、600至3000範圍內之分子量(數量平均)之聚酯二醇。烷二醇為例如丁烷-1,4-二醇、己烷-1,6-二醇、新戊二醇或該等二醇之混合物。合適增鏈劑(ii)為例如用於製備聚酯二醇之二醇類型以及諸如己二胺或異佛爾酮二胺之二胺。合適二異氰酸酯(iii)之實例為4,4'-二苯甲烷二異氰酸酯、異佛爾酮二異氰酸酯或二異氰酸己二酯。聚胺基甲酸酯係以本來已知之方式藉由使起始物質反應製備，其中異氰酸酯基與反應性基團之異氰酸酯基之當量比維持為0.9:1至1.1:1。

亦可使用氧化性乾燥黏合劑。可提及之該等黏合劑為如申請案EP 170184及EP 270795中所述、以聚丁二烯、苯乙烯及順丁烯二酸酐為主且具有離子基之黏合劑。

親水性聚合物通常具有2000 g/mol至60 000 g/mol、較佳2500 g/mol至25 000 g/mol之平均分子量(數量平均)。以總調配物重量計，其係以2.5至40重量%、較佳2.5至10重量%之濃度存在於成品調配物中。

發泡體調配物通常為預混物。其通常在施用之前用0至80%之量的水稀釋。

可撓性發泡體可以本來已知之方式藉由攪拌或振盪製備。另一可能性為施用期間使用起泡劑當場製備。

可提及之製備本發明之調配物的起泡劑為CO₂、N₂O、低碳烷(諸如丙烷或正丁烷、異丁烷)、含鹵素低碳烷及低沸點醚(諸如二甲醚)及該等起泡劑之混合物。

合適誘餌調配物亦可包含顆粒混合物，除包含飼料及本發明之至少一種化合物之粒子外，該顆粒混合物亦包含包括風味不同於第一飼料之飼料且在尺寸、形狀、表面紋理、內部紋理、顏色、密度及/或含量方面與先提及之粒子不同的粒子。舉例而言，非殺齧齒動物性粒子係以2.5至10重量%(以總調配物計)之量存在。非殺齧齒動物性粒子較佳以穀物為主且較佳包含至少一種選自由巧克力、經乾燥且經研磨之甲殼動物、酵母、糞便物、魚粕粉、肉及漿果組成之群的其他引誘劑。該等顆粒調配物之實例描述於WO 2007/031796中。

因此，本發明亦關於防治有害之齧齒動物之方法，其中在有害脊椎動物之棲息地施用本發明之誘餌調配物。

本發明此外係關於本發明之誘餌調配物防治有害之齧齒動物之用途。

誘餌調配物適於室內施用，例如地窖、倉庫、食品室、動物房；或排水溝及戶外施用，例如有害之齧齒動物行走線路或其棲息之洞中。

將本發明之誘餌調配物施用於誘餌盒中。該等誘餌盒描述於例如US 3,750,326、US 4,349,982、DE-A 195 01 892、WO 02/102147、DE-A 10 2004 022 105及DE-A 10 2004 022 103中。

根據本發明使用之組合物亦可含有其他活性成分，例如其他殺有害生物劑、殺昆蟲劑、除草劑、殺真菌劑、其他殺有害生物劑或殺細菌劑；肥料，諸如硝酸銨、尿素、鉀鹼及過磷酸鹽；植物毒素及植物生長調節劑；安全劑及殺線蟲劑。該等其他成分可依序使用或與上述組合物組合使用，適當時，亦在臨用前添加(桶混)。舉例而言，可在用其他活性成分處理之前或之後，用本發明之組合物對植物進行噴灑。

該等藥劑可以1:10至10:1之重量比與根據本發明所使用之藥劑混合。將作為殺有害生物劑之式(I)化合物或包含其之組合物以使用形式與其他殺有害生物劑混合通常產生更廣譜的殺有害生物作用。

可與本發明之化合物一起使用且可產生潛在協同效應之殺有害生物劑之以下清單M旨在說明可能之組合，但不強加任何限制：

M.1. 有機(硫代)磷酸酯：歐殺松(acephate)、亞滅松(azamethiphos)、乙基穀硫磷(azinphos-ethyl)、穀硫磷(azinphos-methyl)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、毒蟲畏(chlorfenvinphos)、氯甲磷(chlormephos)、陶斯松(chlorpyrifos)、甲基陶斯松(chlorpyrifos-methyl)、蠅毒磷(coumaphos)、殺螟腈(cyanophos)、滅賜松(demeton-S-methyl)、二嗪農(diazinon)、敵敵畏(dichlorvos)/DDVP、百治磷(dicrotophos)、樂果(dimethoate)、甲基毒蟲畏(dimethylvinphos)、乙拌磷(disulfoton)、EPN、乙硫磷

(ethion)、普伏松(ethoprophos)、伐滅磷(famphur)、芬滅松(fenamiphos)、殺螟硫磷(fenitrothion)、倍硫磷(fenthion)、吡氟硫磷(flupyrazophos)、噻唑硫磷(fosthiazate)、庚硫磷(heptenophos)、異噁唑磷(isoxathion)、馬拉硫磷(malathion)、滅蚜磷(mecarbam)、甲胺磷(methamidophos)、殺撲磷(methidathion)、速滅磷(mevinphos)、久效磷(monocrotophos)、乃力松(naled)、毆滅松(omethoate)、滅多松(oxydemeton-methyl)、對硫磷(parathion)、甲基對硫磷(parathion-methyl)、稻豐散(phenthoate)、甲拌磷(phorate)、伏殺磷(phosalone)、亞胺硫磷(phosmet)、磷胺(phosphamidon)、腈肟磷(phoxim)、蟲蟊磷(pirimiphos-methyl)、丙溴磷(profenofos)、烯蟲磷(propetamphos)、丙硫磷(prothiofos)、吡唑硫磷(pyraclofos)、必芬松(pyridaphenthion)、喹硫磷(quinalphos)、治螟磷(sulfotep)、丁噻硫磷(tebupirimfos)、亞培松(temephos)、託福松(terbufos)、殺有害生物畏(tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷(thiometon)、三唑磷(triazophos)、三氯松(trichlorfon)、繁米松(vamidothion)；

M.2. 胺基甲酸酯：得滅克(aldicarb)、阿蘭克(alanycarb)、免敵克(bendiocarb)、本夫克(benfuracarb)、丁酮威(butocarboxim)、丁酮磯威(butoxycarboxim)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、丁基加保扶(carbosulfan)、乙硫甲威(ethiofencarb)、仲丁威(fenobucarb)、線蟲脒(formetanate)、夫硫克(furathiocarb)、滅必蟲(isoprocarb)、滅賜克(methiocarb)、滅多蟲(methomyl)、治

滅蟲(metolcarb)、歐殺滅(oxamyl)、抗蚜威(pirimicarb)、殘殺威(propoxur)、硫地克(thiodicarb)、久效威(thiofanox)、混滅威(trimethacarb)、XMC、滅殺威(xylylcarb)、啞蚜威(triazamate)；

M.3.擬除蟲菊酯：阿納寧(acrinathrin)、丙烯除蟲菊酯(allethrin)、右旋順式反式丙烯除蟲菊酯(d-cis-trans allethrin)、右旋反式丙烯除蟲菊酯(d-trans allethrin)、畢芬寧(bifenthrin)、生物丙烯除蟲菊酯(bioallethrin)、生物丙烯除蟲菊酯S-環戊烯基、生物苺呋菊酯(bioresmethrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、 β -賽扶寧(beta-cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、 λ -賽洛寧(lambda-cyhalothrin)、 γ -賽洛寧(gamma-cyhalothrin)、賽滅寧(cypermethrin)、亞滅寧(alpha-cypermethrin)、高效氯氰菊酯(beta-cypermethrin)、 θ -氯氰菊酯(theta-cypermethrin)、 ζ -氯氰菊酯(zeta-cypermethrin)、賽酚寧(cyphenothrin)、第滅寧(deltamethrin)、益避寧(empenthrin)、益化利(esfenvalerate)、依芬寧(etofenprox)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、護賽寧(flucythrinate)、氯氯苯菊酯(flumethrin)、氯胺氯菊酯(tau-fluvalinate)、合芬寧(halfenprox)、依普寧(imiprothrin)、美特寧(metofluthrin)、百滅寧(permethrin)、酚丁滅虱(phenothrin)、普亞列寧(prallethrin)、丙氯菊酯(profluthrin)、除蟲菊酯(pyrethrin)(除蟲菊(pyrethrum))異列滅寧(resmethrin)、氯矽菊酯(silafluofen)、七氯菊酯(tefluthrin)、治滅寧(tetramethrin)、

四溴菊酯(tralomethrin)、拜富寧(transfluthrin)；

M.4.保幼激素模擬物：烯蟲乙酯(hydroprene)、烯蟲炔酯(kinoprene)、烯蟲酯(methoprene)、苯氧威(fenoxycarb)、百利普芬(pyriproxyfen)；

M.5.菸鹼受體促效劑/拮抗劑化合物：亞滅培(acetamiprid)、蟲蟎腈(bensultap)、培丹(cartap hydrochloride)、可尼丁(clothianidin)、呋蟲胺(dinotefuran)、益達胺(imidacloprid)、噻蟲嗪(thiamethoxam)、尼藤吡藍(nitenpyram)、尼古丁(nicotine)、賜諾殺(spinosad)(異位促效劑)、賜奈托姆(spinetoram)(異位促效劑)、噻蟲啉(thiacloprid)、殺有害生物環(thiocyclam)、殺有害生物雙(thiosultap-sodium)及AKD1022；

M.6. GABA 調控氯離子通道拮抗劑化合物：氯丹(chlordane)、硫丹(endosulfan)、 γ -HCH(靈丹(lindane))；乙醯普羅(acetoprole)、乙蟲清(ethiprole)、氟蟲腈(fipronil)、吡氟普羅(pyrafluprole)、吡普羅(pyriprole)、凡尼普羅(vaniliprole)；

M.7.氯離子通道活化劑：阿巴丁(abamectin)、因滅汀(emamectin benzoate)、密滅汀(milbemectin)、萊滅汀(lepimectin)；

M.8. METI I 化合物：芬那割奎(fenazaquin)、芬普蟎(fenpyroximate)、嘧蟎醚(pyrimidifen)、比達本(pyridaben)、得布芬比(tebufenpyrad)、唑蟲醯胺(tolfenpyrad)、氟芬林(flufenerim)、魚藤酮(rotenone)；

M.9. METI II及III化合物：阿色奎西(acequinocyl)、氟西比林(flucyprim)、伏蟻脞(hydramethylnon)；

M.10.氧化磷酸化去偶合劑：克芬那比(chlorfenapyr)、DNOC；

M.11.氧化磷酸化抑制劑：亞環錫(azocyclotin)、環己錫(cyhexatin)、汰芬隆(diafenthiuron)、芬布賜(fenbutatin oxide)、毆蟎多(propargite)、得克滿(tetradifon)；

M.12.蛻皮干擾劑：賽滅淨(cyromazine)、環蟲醯肼(chromafenozide)、氯醯肼(halofenozide)、甲氧蟲醯肼(methoxyfenozide)、得芬諾(tebufenozide)；

M.13.增效劑：協力精(piperonyl butoxide)、脫葉磷(tribufos)；

M.14.鈉通道阻斷劑化合物：因得克(indoxacarb)、美氟脞(metaflumizone)；

M.15.薰劑(Fumigant)：甲基溴、氯化苦硫醯氯(chloropicrin sulfuryl fluoride)；

M.16.選擇性進食阻斷劑：克里婁替(crylotie)、吡蚜酮(pymetrozine)、氟尼胺(flonicamid)；

M.17.蟎生長抑制劑：克芬蟎(clofentezine)、合賽多(hexythiazox)、依殺蟎(etoxazole)；

M.18.甲殼素合成抑制劑：布芬淨(buprofezin)、雙三氟蟲脲(bistrifluron)、克福隆(chlorfluazuron)、二福隆(diflubenzuron)、氟環脲(flucycloxuron)、氟芬隆(flufenoxuron)、六伏隆(hexaflumuron)、祿芬隆(lufenuron)、

諾華隆 (novaluron)、紐伏隆 (noviflumuron)、得福隆 (teflubenzuron)、殺鈴脲 (triflumuron)；

M.19.脂質生物合成抑制劑：螺螞酯 (spirodiclofen)、斯必麥芬 (spiromesifen)、斯必馬特 (spirotetramat)；

M.20.多卡巴胺能促效劑 (octapaminergic agonist)：阿米曲士 (amitraz)；

M.21.尼魚丁受體調節劑 (ryanodine receptor modulator)：福本胺 (flubendiamide)、(R)-,(S)-3-氯-N1-{2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基}-N2-(1-甲基-2-甲基磺醯基乙基)鄰苯二甲醯胺 (M21.1)；

M.22.其他：磷化鋁 (aluminium phosphide)、醯胺氟美 (amidoflumet)、苯氯噻嗪 (benclothiaz)、苯螞特 (benzoximate)、聯苯肼酯 (bifenazate)、硼砂、溴丙酸鹽、氟化物、塞諾吡芬 (cyenopyrafen)、噻氟美芬 (cyflumetofen)、滅螞猛 (chinomethionate)、大克螞 (dicofol)、氟乙酸鹽、磷、啖蟲丙醚 (pyridalyl)、比氟喹啉 (pyrifluquinazon)、硫、、有機硫化合物、酒石酸氧銻鉀 (tartar emetic)、磺噁氟 (sulfoxaflor)、4-丁-2-炔基氧基-6-(3,5-二甲基-哌啶-1-基)-2-氟-嘓啶 (M22.1)、

3-苯甲醯基胺基-N-[2,6-二甲基-4-(1,2,2,2-四氟-1-三氟甲基-乙基)-苯基]-2-氟-苯甲醯胺 (M22.2)、

4-[5-(3,5-二氯-苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫-異噁唑-3-基]-2-甲基-N-吡啶-2-基甲基-苯甲醯胺 (M22.3)、

4-[5-(3,5-二氯-苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫-異噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2,2,2-三氟-乙基)-苯甲醯胺(M22.4)、

4-[5-(3,5-二氯-苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫-異噁唑-3-基]-2-甲基-N-噁唑-2-基甲基-苯甲醯胺(M22.5)、

4-[5-(3,5-二氯-苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫-異噁唑-3-基]-2-甲基-N-(四氫-呋喃-2-基甲基)-苯甲醯胺(M22.6)、

4-{[(6-溴吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M22.7)、

4-{[(6-氟吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M22.8)、

4-{[(2-氯-1,3-噁唑-5-基)甲基](2-氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M22.9)、

4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M22.10)、

4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M22.11)、

4-{[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](甲基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M22.12)、

4-{[(5,6-二氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M22.13)、

4-{[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](環丙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M22.14)、

4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](環丙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M22.15)、

4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](甲基)胺基}呋喃-2(5H)-酮
(M22.16)、

環丙烷乙酸 1,1'-[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-4-
[[(2-環丙基乙醯基)氧基]甲基]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-
十氫-12-羥基-4,6a,12b-三甲基-11-側氧基-9-(3-吡啶基)-
2H,11H-萘并[2,1-b]呋喃并[3,4-e]呋喃-3,6-二基]酯
(M22.17)、

8-(2-環丙基甲氧基-4-甲基-苯氧基)-3-(6-甲基-噻吩-3-
基)-3-氮雜-雙環[3.2.1]辛烷(M22.18)；

M.23. N-R'-2,2-二鹵基-1-R''環-丙烷甲醯胺-2-(2,6-二氯-
 α,α,α -三氟-對甲苯基)脞或 N-R'-2,2-二(R''')丙醯胺-2-(2,6-
二氯- α,α,α -三氟-對甲苯基)-脞，其中 R' 為甲基或乙基，鹵
基為氯或溴，R'' 為氫或甲基且 R''' 為甲基或乙基；

M.24. 鄰胺基苯甲醯胺 (Anthranilamide)：氯蟲醯胺
(chloranthraniliprole)、氰蟲醯胺(cyantraniliprole)；

5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[4-氰基-2-(1-環丙
基-乙基胺甲醯基)-6-甲基-苯基]-醯胺(M24.1)；

5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[2-氯-4-氰基-6-
(1-環丙基-乙基胺甲醯基)-苯基]-醯胺(M24.2)；

5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[2-溴-4-氰基-6-
(1-環丙基-乙基胺甲醯基)-苯基]-醯胺(M24.3)；

5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[2-溴-4-氯-6-
(1-環丙基-乙基胺甲醯基)-苯基]-醯胺(M24.4)；

5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[2,4-二氯-6-(1-

環丙基-乙基胺甲醯基)-苯基]-醯胺(M24.5)；

5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[4-氯-2-(1-環丙基-乙基胺甲醯基)-6-甲基-苯基]-醯胺(M24.6)；

M.25.丙二腈化合物： $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-八氟戊基)-2-(3,3,3-三氟-丙基)丙二腈)、 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_5\text{CF}_2\text{H}$ (2-(2,2,3,3,4,4,5,5,6,6,7,7-十二氟庚基)-2-(3,3,3-三氟-丙基)-丙二腈)、 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{F}$ (2-(3,4,4,4-四氟-3-三氟甲基-丁基)-2-(3,3,3-三氟-丙基)-丙二腈)、 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ (2-(3,3,4,4,5,5,6,6,6-九氟-己基)-2-(3,3,3-三氟-丙基)-丙二腈)、 $\text{CF}_2\text{H}(\text{CF}_2)_3\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ (2,2-雙-(2,2,3,3,4,4,5,5-八氟-戊基)-丙二腈)、 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ (2-(2,2,3,3,4,4,5,5,5-九氟-戊基)-2-(3,3,3-三氟-丙基)-丙二腈)、 $\text{CF}_3(\text{CF}_2)_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ (2-(2,2,3,3,4,4,4-七氟-丁基)-2-(2,2,3,3,4,4,5,5-八氟-戊基)-丙二腈)、 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-八氟-戊基)-2-(2,2,3,3,3-五氟-丙基)-丙二腈)、 $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-八氟戊基)-2-(3,3,4,4,4-五氟丁基)-丙二腈)、 $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-八氟戊基)-2-(3,3,3-三氟-丁基)-丙二腈)；

M.26.微生物干擾劑(Microbial disruptors)：蘇雲金桿菌伊里萊斯亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *Israelensi*)、球形芽孢桿菌(*Bacillus sphaericus*)、蘇雲金桿菌亞莎華亞種

(*Bacillus thuringiensis* subsp. *Aizawai*)、蘇雲金桿菌庫斯塔克亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *Kurstaki*)、蘇雲金芽孢桿菌擬步甲亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *Tenebrionis*)；

群組M之市售化合物可見於The Pesticide Manual，第13版，British Crop Protection Council (2003)以及其他公開案中。

式M6.1之硫代醯胺及其製備已描述於WO 98/28279中。萊滅汀係得知於Agro Project, PJB Publications Ltd, 2004年11月。苯氣噻及其製備已描述於EP-A1 454621中。滅大松及雙氧磷及其製備已描述於Farm Chemicals Handbook，第88卷，Meister Publishing Company, 2001中。乙醯普羅及其製備已描述於WO 98/28277中。美氟脞及其製備已描述於EP-A1 462 456中。氟吡啶福斯(Flupyrzofos)已描述於Pesticide Science 54, 1988，第237-243頁中及US 4822779中。吡氟普羅及其製備已描述於JP 2002193709中及WO 01/00614中。吡普羅及其製備已描述於WO 98/45274中及US 6335357中。胺氟美及其製備已描述於US 6221890中及JP 21010907中。氟芬林及其製備已描述於WO 03/007717中及WO 03/007718中。AKD 1022及其製備已描述於US 6300348中。氣蟲醯胺已描述於WO 01/70671、WO 03/015519及WO 05/118552中。式M24.1之鄰胺基苯甲醯胺衍生物已描述於WO 01/70671、WO 04/067528及WO 05/118552中。噻氟美芬及其製備已描述於WO 04/080180中。胺基喹啉酮化合物比氟喹啉已描述於EP A 109 7932中。磺醯亞胺磺噁氟(Sulfoximine sulfoxaflor)已描述於WO

2006/060029及WO 2007/149134中。炔基醚化合物M22.1已描述於(例如)JP 2006131529中。有機硫化合物已描述於WO 2007060839中。羧醯胺化合物M 22.2係自WO 2007/83394中所知。噁唑啉化合物M 22.3至M 22.6已描述於WO 2007/074789中。呋喃酮化合物M 22.7至M 22.16已描述於(例如)WO 2007/115644中。吡哌喃烯(pyripyropene)衍生物M 22.17已描述於WO 2008/66153 及 WO 2008/108491中。噻嗪化合物M 22.18已描述於JP 2008/115155中。丙二腈化合物已描述於WO 02/089579、WO 02/090320、WO 02/090321、WO 04/006677、WO 05/068423、WO 05/068432及WO 05/063694中。

殺真菌混合搭配物為選自由以下各物質組成之群F之彼等物質：醯基丙胺酸類，諸如苯霜靈(benalexyl)、滅達樂(metalaxyl)、呋醯胺(ofurace)、歐殺斯(oxadixyl)；胺衍生物，諸如阿迪嗎啉(aldimorph)、多寧(dodine)、嗎菌靈(dodemorph)、粉鏽啉(fenpropimorph)、苯鏽啉(fenpropidin)、雙胍鹽(guazatine)、雙胍辛胺(iminoctadine)、螺惡胺(spiroxamine)、三得芬(tridemorph)；苯胺基嘧啶類，諸如比利美沙尼(pyrimethanil)、米潘尼比林(mepanipyrim)或賽普洛(cyprodinyl)；抗生素，諸如環己醯亞胺、灰黃黴素(griseofulvin)、春日黴素(kasugamycin)、遊黴素(natamycin)、多氧菌素(polyoxin)或鏈黴素(streptomycin)；唑類，諸如比多農(bitertanol)、溴克座(bromoconazole)、環克座(cyproconazole)、苯醚甲環唑

(difenoconazole)、二硝基克唑(dinitroconazole)、氟環唑(epoxiconazole)、芬克座(fenbuconazole)、氟喹唑(fluquinconazole)、護矽得(flusilazole)、己唑醇(hexaconazole)、依滅列(imazalil)、葉菌唑(metconazole)、邁克尼(myclobutanil)、平克座(penconazole)、普克利(propiconazole)、撲克拉(prochloraz)、丙硫醇克唑(prothioconazole)、得克利(tebuconazole)、三泰芬(triadimefon)、三泰隆(triadimenol)、賽福座(triflumizole)、環菌唑(triticonazole)、護汰芬(flutriafol)；二羧甲醯亞胺類，諸如依普同(iprodion)、米克啞(myclozolin)、撲滅寧(procymidon)、免克寧(vinclozolin)；二硫代胺基甲酸酯類，諸如福美鐵(ferbam)、代森鈉(nabam)、錳乃浦(maneb)、錳粉克(mancozeb)、威百畝(metam)、免得爛(metiram)、甲基鋅乃浦(propineb)、聚胺基甲酸酯(polycarbamate)、得恩地(thiram)、益穗(ziram)、鋅乃浦(zineb)；雜環化合物，諸如敵菌靈(anilazine)、免賴得(benomyl)、博克利(boscalid)、貝芬替(carbendazim)、萎鏽靈(carboxin)、氧化萎鏽靈(oxycarboxin)、賽座滅(cyazofamid)、邁隆(dazomet)、二硫二氰蔥醌(dithianon)、噁唑菌酮(famoxadone)、咪唑菌酮(fenamidone)、芬瑞莫(fenarimol)、麥穗靈(fuberidazole)、氟多寧(flutolanil)、福拉比(furametpyr)、稻瘟靈(isoprothiolane)、滅鏽胺(mepronil)、氟苯嘧啶醇(nuarimol)、噻菌靈(probenazole)、普奎那茲(proquinazid)、比芬諾(pyrifenox)、百快隆(pyroquilon)、快諾芬(quinoxyfen)、矽硫芬(silthiofam)、

噻苯咪唑(thiabendazole)、賽氟滅(thifluzamide)、甲基-多保淨(thiophanate-甲基)、汰敵寧(tiadinil)、三賽唑(tricyclazole)、賽福寧(triforine)；銅殺真菌劑，諸如波爾多混合物(Bordeaux mixture)、乙酸銅、鹼性氯氧化銅、鹼式硫酸銅；硝基苯基衍生物，諸如百蟎克(binapacryl)、白粉克(dinocap)、大脫蟎(dinobuton)、硝基鄰苯二甲酸異丙基(nitrophthalisopropyl)；苯吡咯，諸如拌種咯(fenpiclonil)或護汰寧(fludioxonil)；硫；其他殺真菌劑，諸如酸化苯并噻二唑-S-甲酯(acibenzolar-S-甲基)、苯噻瓦利(benthiavalicarb)、加普胺(carpropamid)、四氯異苯腈(氯thalonil)、噻芬胺(cyflufenamid)、霜脲氰(cymoxanil)、噠菌清(diclomezin)、二氯西莫(diclocymet)、乙徽威(diethofencarb)、護粒松(edifenphos)、乙噻博胺(ethaboxam)、環醯菌胺(fenhexamid)、三苯醋錫(fentin-acetate)、禾草靈(fenoxanil)、嘧菌脞(ferimzone)、扶吉胺(flauazinam)、福賽得(fosetyl)、乙磷鋁(fosetyl-aluminum)、顯徽威(iprovalicarb)、六氯苯(hexa氯benzene)、美曲芬諾(metrafenon)、賓克隆(pencycuron)、霜徽威(propamocarb)、苯酞(phthalide)、脫克松(tolclofos-甲基)、奎脫辛(quintozene)、氯苯醯胺(zoxamide)；嗜毬果傘素，諸如亞托敏(azoxystrobin)、地莫菌胺(dimoxystrobin)、氟氧菌胺(fluxastrobin)、克收欣(kresoxim-甲基)、苯氧菌胺(metominostrobin)、奧瑞菌胺(oryastrobin)、啞氧菌酯(picoxystrobin)或三氟敏(trifloxystrobin)；次磺酸衍生

物，諸如四氯丹(captafol)、蓋普丹(captan)、益發靈(dichlofluanid)、福爾培(folpet)、益洛寧(tolyfluanid)；肉桂醯胺類及類似物，諸如達滅芬(dimethomorph)、氟美醯胺(flumetover)或氟嗎啉(flumorph)。

可藉由此項技術中已知之任何施用方法使有害動物(亦即節肢動物及線蟲)、植物、植物生長於其中之土壤或水與本發明式(I)化合物或含有其之組合物接觸。如所指，「接觸」包括直接接觸(將化合物/組合物直接施用於有害動物或植物上，通常施用於植物之葉、莖或根)與間接接觸(將化合物/組合物施用於害蟲或植物之所在地)。

此外，有害動物可藉由使目標害蟲、其食物源、棲息地、滋生地或其所在地與殺有害生物有效量之式(I)化合物接觸來防治。如所指，該施用可在害蟲侵染所在地、生長中之作物或已收穫之作物之前或之後進行。

「所在地」意謂害蟲或寄生蟲正生長或可生長於其中之棲息地、滋生地、栽培植物、植物繁殖材料(諸如種子)、土壤、區域、材料或環境。

一般而言，「殺有害生物有效量」意謂對生長達成可觀察之效應所需之活性成分之量，所述效應包括壞死、死亡、延遲、防止及移除、破壞或以其他方式減少目標生物體之出現及活性之效應。用於本發明之各種化合物/組合物之殺有害生物有效量可變化。組合物之殺有害生物有效量亦根據主要條件(諸如所要殺有害生物效應及持續時間、天氣、目標種、所在地、施用模式及其類似條件)而變化。

式(I)化合物及其組合物不僅可用於保護諸如樹、護板、枕木等木製材料，及諸如房屋、外屋、工廠之建築物，而且可用於保護建築材料、傢具、皮革、纖維、乙烯基物品、電線及電纜等物免遭螞蟻及/或白蟻侵害，且用於防治螞蟻及/或白蟻以免危害作物或人類(例如當害蟲侵入房屋及公共設施中時)。式(I)化合物不僅施用於周圍土壤表面或地板下土壤中以保護木製材料，而且其亦可施用於諸如地板下混凝土、壁櫥柱、樑、膠合板、傢具等物表面的木材物品，諸如粒子板、半板等木製物品，及諸如包覆電線、乙烯基薄片之乙烯基物品，諸如苯乙烯發泡體等絕熱材料。在施用對抗危害作物及人類之螞蟻的情況下，將本發明之螞蟻防治劑施用於作物或周圍土壤，或直接施用於螞蟻之巢穴或其類似物。

式(I)化合物亦可預防性施用於預期害蟲會出現之地方。

式(I)化合物亦可藉由使植物與殺有害生物有效量之式(I)化合物接觸而用以保護生長中之植物免受害蟲侵襲或侵染。如所指，「接觸」包括直接接觸(將化合物/組合物直接施用於有害動物及/或植物上，通常施用於植物之葉、莖或根)與間接接觸(將化合物/組合物施用於有害動物及/或植物之所在地)。

在土壤處理或施用於害蟲棲息地或巢穴之情況下，活性成分之量係在每100平方公尺0.0001 g至500 g、較佳每100平方公尺0.001 g至20 g之範圍內。

在材料保護中，常用施用率為(例如)每平方公尺受處理

材料0.01 g至1000 g活性化合物，理想地為每平方公尺0.1 g至50 g。

用於浸漬材料之殺昆蟲性組合物通常含有0.001至95重量%、較佳0.1至45重量%且更佳1至25重量%之至少一種拒避劑及/或殺昆蟲劑。

用於誘餌組合物時，活性成分之典型含量為0.001重量%至15重量%、理想地0.001重量%至5重量%之活性化合物。

用於噴灑組合物時，活性成分之含量為0.001至80重量%，較佳0.01至50重量%且最佳0.01至15重量%。

用於處理作物植物時，本發明之活性成分之施用率可在每公頃0.1 g至4000 g、理想地每公頃25 g至600 g、更理想地每公頃50 g至500 g之範圍內。

在種子處理中，活性成分之施用率通常為每100公斤種子0.1 g至10 kg，較佳每100公斤種子1 g至5 kg，尤其每100公斤種子1 g至200 g。

現藉由以下實例更詳細說明本發明。

I. 實驗程序

在適當修改起始化合物的情況下使用以下合成實例中所示之方案來獲得式(I)之其他化合物。

產物係藉由聯合之高效液相層析/質譜術(HPLC/MS)、藉由其於CDCl₃或d₆-DMSO中之¹H-NMR(400 MHz)或其熔點表徵。HPLC管柱：RP-18管柱(Merck KgaA, Germany之Chromolith Speed ROD)。溶離：5:95至95:5比率之乙腈+0.1%三氟乙酸(TFA)/水，在40°C下，5分鐘。MS：四極

電噴霧電離，80V(正離子模式)。

I.1 製備 5-(2,4-雙(三氟甲基)苯基)-1,1-二側氧基-2-喹啉-4-基甲基-1,2-二氫-1-苯并[d]異噻唑-3-酮(5-(2,4-雙(三氟甲基)苯基)-2-(喹啉-4-基甲基)糖精)(化合物 I.1)

I.1.1 製備 5-溴-2-氯磺醯基-苯甲酸甲酯

在 0°C 下向 2-胺基-5-溴-苯甲酸甲酯(25.0 g, 109 mmol)於鹽酸水溶液(10 M, 100 ml)中之溶液中緩慢添加 NaNO_2 (8.3 g, 119 mmol)於水(25 ml)中之溶液。在 0°C 下攪拌 1 小時後，將所得反應混合物添加至 SO_2 於 1,2-二氯乙烷(75 ml)中之含有 CuCl_2 (0.50 g, 3.7 mmol)及氯化苯甲基三甲基銨(1.41 g, 7.6 mmol)之冷卻至 0°C 溫度的飽和溶液中。添加後，加熱反應混合物至 50°C 歷時 1 小時，冷卻至周圍溫度且用 CH_2Cl_2 (250 ml)萃取。用飽和 NaHCO_3 水溶液洗滌有機相，經 Na_2SO_4 乾燥，過濾且在真空中濃縮。獲得 3.6 g 量之殘餘物 5-溴-2-氯-磺醯基-苯甲酸甲酯。

I.1.2 製備 5-溴-2-(喹啉-4-基甲基)胺基磺醯基-苯甲酸甲酯

在周圍溫度下將喹啉-4-基甲基胺(4.50 g, 24 mmol)、粗 5-溴-2-氯-磺醯基-苯甲酸甲酯(7.59 g, 24 mmol，根據 I.1.1 製備)及三乙胺(4.04 ml, 29 mmol)於 CH_2Cl_2 (100 ml)中之溶液攪拌 10 小時。向所得反應混合物中添加水(100 ml)。分離各相後，經 Na_2SO_4 乾燥有機相，過濾且在真空中濃縮。藉由管柱層析法(梯度：環己烷/乙酸乙酯；100:1 至 1:9)純化殘餘物以得到 5-溴-2-(喹啉-4-基甲基-胺基磺醯基-苯甲酸甲酯(2.48 g)。

I.1.3 製備 5-(2,4-雙(三氟甲基)苯基)-1,1-二側氧基-2-喹啉-4-基甲基-1,2-二氫-1-苯并[d]異噻唑-3-酮

在固定二異丙基乙基胺 (1.20 g, 4.08 mmol, PS-DIPEA, 獲自 Novabiochem)、四氟硼酸三-第三丁基鎂 (0.017 g, 0.06 mmol) 及雙(三苯膦基)氯化鈮 II (0.025 g, 0.04 mmol) 存在下使 5-溴-2-(喹啉-4-基甲基)胺基磺醯基-苯甲酸甲酯 (0.50 g, 1.2 mmol, 根據 I.1.2 製備) 及 2,4-雙(三氟甲基)苯基-酮酸 (0.34 g, 1.3 mmol) 於乙腈 (5 ml) 及水 (2 ml) 中之溶液回流 8 小時。過濾所得反應混合物, 用乙腈 (10 ml) 沖洗滯留之固體且在真空中濃縮所得濾液。藉由管柱層析法 (梯度: 環己烷/乙酸乙酯; 90:10 至 40:60) 純化殘餘物以得到 5-(2,4-雙(三氟甲基)苯基)-1,1-二側氧基-2-喹啉-4-基甲基-1,2-二氫-1-苯并[d]異噻唑-3-酮 (0.096 g)。

I.2 製備 5-(2,4-二氟苯基)-1,1-二側氧基-2-喹啉-4-基甲基-1,2-二氫-1-苯并[d]異噻唑-3-酮 (5-(2,4-二氟苯基)-2-(喹啉-4-基甲基)糖精) (化合物 1.2)

I.2.1 製備 5-溴-1,1-二側氧基-2-喹啉-4-基甲基-1,2-二氫-1-苯并[d]-異噻唑-3-酮

在 100°C 下將 5-溴-2-(喹啉-4-基甲基)胺基磺醯基-苯甲酸甲酯 (0.90 g, 2.1 mmol, 根據 I.1.2 製備) 於冰乙酸 (50 ml) 中之溶液攪拌 10 小時。在真空中移除冰乙酸。將殘餘物溶解於乙酸乙酯中, 用飽和 NaHCO₃ 溶液洗滌, 經 Na₂SO₄ 乾燥, 過濾且在真空中濃縮。從而獲得 7.0 g 之量的 5-溴-1,1-二側氧基-2-喹啉-4-基甲基-1,2-二氫-1-苯并[d]-異噻唑-3-酮。

I.2.2 製備 5-(2,4-二氟苯基)-1,1-二側氧基-2-噻啉-4-基甲基-1,2-二氫-1-苯并[d]異噻唑-3-酮

在三乙胺(0.240 g, 2.4 mmol)、四氟硼酸三-第三丁基鎂(0.010 g, 0.04 mmol)及雙(三苯膦基)氯化鈮II(0.015 g, 0.02 mmol)存在下使 5-溴-1,1-二側氧基-2-噻啉-4-基甲基-1,2-二氫-1-苯并[d]異噻唑-3-酮(0.300 g, 0.7 mmol, 根據 I.2.1 製備)及 2,4-二氟苯基-酮酸(0.24 g, 2.4 mmol)於乙腈(5 ml)及水(2 ml)中之溶液回流 3.5 小時。在真空中濃縮反應混合物。將殘餘物溶解於冰乙酸中且加熱至 100°C 歷時 10 小時。在真空中濃縮反應混合物。將殘餘物溶解於乙酸乙酯中, 用飽和 NaHCO₃ 水溶液洗滌, 經 Na₂SO₄ 乾燥, 過濾且在真空中濃縮。藉由管柱層析法(梯度: 環己烷/乙酸乙酯; 99:1 至 30:70)純化殘餘物以得到 5-(2,4-二氟苯基)-1,1-二側氧基-2-噻啉-4-基甲基-1,2-二氫-1-苯并[d]異噻唑-3-酮(45 mg)。

I.3 製備 5-(2,4-二氟苯基)-2-(2-甲氧基吡啶-4-基甲基)-1,1-二側氧基-1,2-二氫苯并[d]亞異噻唑-3-基胺(化合物 I.3)

I.3.1 製備 5-(2,4-二氟苯基)苯并[d]異噻唑

在 75°C 下將 5-溴苯并[d]異噻唑(5.0 g, 23 mmol, 根據 EP 454621 製備)、2,4-二氟苯基酮酸(5.4 g, 34 mmol)、四氟硼酸三-第三丁基鎂(0.9 g)、雙(三苯膦基)氯化鈮(II)(1.3 g)及三乙胺(14 ml)於乙腈(40 ml)及水(20 ml)中之溶液加熱 2 小時。藉由蒸餾移除溶劑, 添加水且用二氯甲烷萃取產物。經 Na₂SO₄ 乾燥有機層, 過濾且在真空中濃縮以得到粗

5-(2,4-二氟苯基)苯并[d]異噻唑(5.8 g)。

I.3.2 製備 2',4'-二氟-4-巰基聯苯-3-基甲腈

在室溫下向粗 5-(2,4-二氟苯基)苯并[d]異噻唑(5.8 g, 23 mmol, 根據實例 I.3.1 製備)於乙腈(100 ml)中之溶液中添加甲醇鈉(2.9 g, 53 mmol)。將混合物加熱至回流歷時 2 小時, 隨後藉由蒸餾移除溶劑, 添加水且用 HCl 水溶液(10% 濃度)將混合物酸化。用二氯甲烷萃取反應混合物且經 Na_2SO_4 乾燥有機層, 過濾且在真空中濃縮。將殘餘物溶解於甲基第三丁基醚中且添加甲醇鈉(30% 濃度, 於甲醇中)。藉由過濾收集所得固體沈澱物, 用甲基第三丁基醚洗滌且在真空中乾燥。將乾燥固體沈澱物溶解於 HCl 水溶液(10% 濃度)中且用二氯甲烷萃取。經 Na_2SO_4 乾燥有機層, 過濾且在真空中濃縮以得到粗 2',4'-二氟-4-巰基聯苯-3-基甲腈(4.5 g)。

I.3.3 製備 3-氟基-2',4'-二氟聯苯-4-磺醯氯

使氯氣通過粗 2',4'-二氟-4-巰基-聯苯-3-基甲腈(4.5 g, 18 mmol, 根據實例 I.3.2 製備)於乙酸(45 ml)及水(3 ml)中之溶液直至反應完成。添加水且用二氯甲烷萃取產物。經 Na_2SO_4 乾燥有機層, 過濾且在真空中濃縮。經管柱層析法(溶離劑: 甲苯)純化殘餘物以得到 3-氟基-2',4'-二氟聯苯-4-磺醯氯(4.6 g)。

I.3.4 3-氟基-2',4'-二氟聯苯-4-磺酸 N-(2-甲氧基吡啶-4-基甲基)醯胺

在室溫下向(2-甲氧基吡啶-4-基)-甲基胺(705 mg, 5.1

mmol)、吡啶(1.7 ml)及二甲基胺基吡啶(12 mg)於四氫呋喃(30 ml)中之溶液中添加3-氰基-2',4'-二氟聯苯-4-磺醯氯(1.46 g, 4.6 mmol, 根據實例I.3.3製備)於四氫呋喃(20 ml)中之溶液, 且將混合物攪拌48小時。添加水且用二氯甲烷萃取產物。用HCl水溶液(10%濃度)及碳酸鈉水溶液(10%濃度)洗滌有機層。經Na₂SO₄乾燥有機層, 過濾且在真空中濃縮以得到3-氰基-2',4'-二氟聯苯-4-磺酸N-(2-甲氧基-吡啶-4-基甲基)醯胺(1.7 g)。

I.3.5 製備 5-(2,4-二氟苯基)-2-(2-甲氧基吡啶-4-基甲基)-1,1-二側氧基-1,2-二氫-苯并[d]亞異噻唑-3-基胺

向3-氰基-2',4'-二氟聯苯-4-磺酸N-(2-甲氧基吡啶-4-基甲基)醯胺(1.0 g, 2.4 mmol, 根據實例I.3.4製備)於甲苯(100 ml)中之溶液中添加碳酸鈉(0.77 g, 7.2 mmol)於水(50 ml)中之溶液。在室溫下將混合物攪拌24小時。分離有機相且用乙酸乙酯萃取水相。經NaSO₄乾燥合併之有機相, 過濾且在真空中濃縮以得到5-(2,4-二氟-苯基)-2-(2-甲氧基吡啶-4-基甲基)-1,1-二側氧基-1,2-二氫-苯并[d]亞異噻唑-3-基胺(0.9 g; m.p.=173°C; HPLC/MS: t_r=2.9 min, (m/z)=416[M+H]⁺)。

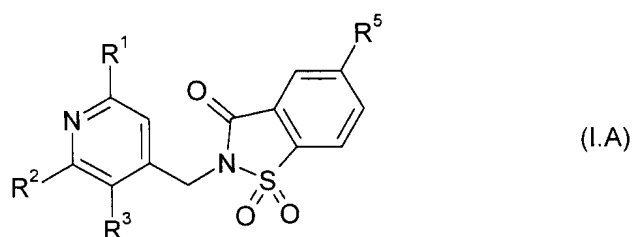
I.4 製備 5-(2,4-二氟苯基)-2-(2-甲氧基吡啶-4-基甲基)-1,1-二側氧基-1,2-二氫-苯并[d]異噻唑-3-酮(化合物I.4)

向5-(2,4-二氟苯基)-2-(2-甲氧基吡啶-4-基甲基)-1,1-二側氧基-1,2-二氫苯并[d]亞異噻唑-3-基胺(0.6 g, 1.4 mmol, 根據實例I.3.5製備)於二噁烷(30 ml)中之溶液中添加HCl水溶液(10%濃度, 5 ml)。在室溫下將溶液攪拌5小

時。添加水且用二氯甲烷萃取產物。經 Na_2SO_4 乾燥有機層，過濾且在真空中濃縮。藉由管柱層析法(溶離劑：環己烷/乙酸乙酯)純化殘餘物以得到5-(2,4-二氟苯基)-2-(2-甲氧基吡啶-4-基甲基)-1,1-二側氧基-1,2-二氫-苯并[d]異噻唑-3-酮(0.73 mmol, 300 mg)。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 3.92$ (s, 3H), 4.86 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.01 (m, 3H), 7.44 (m, 1H), 8.02 (s, 2H), 8.18 ppm (m, 2H)。

根據上述方法製備式(I.A)磺醯胺化合物，亦即，其中m為0、X為O、Y為CH且Z為化學鍵之式(I)化合物，



其中 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^5 具有下表I中所列之含義(化合物I.5至I.48)。

表 I

	R^1	R^2	R^3	R^5	HPLC-MS mp
I.5	H	-CH=CH-CH=CH-		4-氟苯基	
I.6	H	-CH=CH-CH=CH-		4-(三氟甲基)-苯基	
I.7	H	-CH=CH-CH=CH-		4-氟基苯基	
I.8	H	-CH=CH-CH=CH-		4-(三氟甲氧基)-苯基	
I.9	H	-CH=CH-CH=CH-		2,4-二氟苯基	
I.10	H	-CH=CH-CH=CH-		2,4-二(三氟甲基)苯基	RT=3.229 min , M _w =468.60 g/mol
I.11	H	-CH=CH-CH=CH-		2-氟-4-(三氟-甲基)苯基	
I.12	H	-CH=CH-CH=CH-		2-(三氟甲基)-苯基	
I.13	H	-CH=CH-CH=CH-		2-氟苯基	
I.14	H	-CH=CH-CH=CH-		4-氟-2-(三氟-甲基)苯基	
I.15	H	-CH=CH-CH=CH-		2,4-二氟苯基	
I.16	H	-CH=CH-CH=CH-		2-氟苯基	
I.17	H	H	H	2,4-二氟苯基	RT=2.813 min , M _w =417.95 g/mol ; 151.5°C

	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	HPLC-MS mp
I.18	OCH ₃	H	H	2,4-二氯苯基	RT=3.855 min , M _w =449.05 g/mol ; 139.5°C
I.19	OCH ₃	H	H	2,4-二氯苯基	RT=3.680 min , M _w =417.10 g/mol
I.20	H	H	H	2,4-二氯苯基	RT=2.587 min , M _w =387.05 g/mol
I.21	OCH ₃	H	H	4-(三氯甲基)-苯基	RT=3.896 min , M _w =517.05 g/mol
I.22	H	CH ₃	CH ₃	4-(三氯甲基)-苯基	RT=3.271 min , M _w =515.05 g/mol
I.23	H	CH ₃	CH ₃	2,4-二氯苯基	RT=2.837 min , M _w =415.05 g/mol
I.24	H	CH ₃	CH ₃	2,4-二氯苯基	RT=3.013 min , M _w =446.60 g/mol
I.25	H	H	CH ₃	2,4-二氯苯基	RT=2.605 min , M _w =400.70 g/mol
I.26	H	H	CH ₃	2,4-二(三氯甲基)苯基	RT=3.237 min , M _w =501.05 g/mol
I.27	H	-CH=C(OCH ₃)-CH=CH-		2,4-二氯苯基	RT=2.892 min , M _w =467.05 g/mol
I.28	H	-CH=C(CF ₃)-CH=CH-		2,4-二氯苯基	RT=3.809 min, M _w =504.60 g/mol
I.29	H	H	F	2,4-二氯苯基	RT=3.650 min , M _w =437.05 g/mol ; 180°C
I.30	H	-CH=C(CF ₃)-CH=CH-		2,4-二氯苯基	RT=4.108 min, M _w =536.50 g/mol; 224°C
I.31	H	-CH=CF-CH=CH-		2,4-二氯苯基	RT=3.733 min , M _w =487.00 g/mol
I.32	H	H	CH ₃	2,4-二氯苯基	RT=3.268 min , M _w =433.00 g/mol ; 197°C
I.33	H	H	H	2-氯-4-(三氯甲基)苯基	RT=2.951 min , M _w =452.60 g/mol ; 179°C
I.34	H	CH ₃	CH ₃	2-氯-4-(三氯甲基)苯基	RT=3.102 min , M _w =481.15 g/mol ; 170°C
I.35	H	CH ₃	CH ₃	4-氯-2-(三氯甲基)苯基	RT=3.061 min , M _w =481.15 g/mol
I.36	H	H	H	2,3,4-三氯苯基	RT=2.643 min , M _w =405.15 g/mol ; 165°C

	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	HPLC-MS mp
I.37	OCH ₃	H	H	2,3,4-三氟苯基	RT=3.373 min , M _w =434.60 g/mol
I.38	H	CH ₃	CH ₃	2,3,4-三氟苯基	RT=2.741 min , M _w =433.15 g/mol ; 143°C
I.39	H	-CH=C(OCH ₃)-CH=CH-		2,4-二氯苯基	RT=3.220 min , M _w =498.50 g/mol
I.40	OCH ₃	H	H	2-氯-4-(三氟甲基)苯基	RT=3.738 min , M _w =482.60 g/mol
I.41	H	H	H	2-氯-4-氟基苯基	RT=2.630 min , M _w =410.15 g/mol
I.42	OCH ₃	H	H	2-氯-4-氟基苯基	RT=3.542 min , M _w =440.15 g/mol
I.43	H	CH ₃	CH ₃	4-氟基-2-(三氟甲基)苯基	RT=2.856 min , M _w =472.15 g/mol ; 205°C
I.44	H	-CH=CH-CH=CH-		2,3,4-三氟苯基	RT=3.129 min , M _w =455.2 g/mol
I.45	H	H	H	3-氯-5-(三氟甲基)-2-吡啶基	RT=2.818 min , M _w =454.2 g/mol
I.46	OCH ₃	H	H	3-氯-5-(三氟甲基)-2-吡啶基	RT=3.808 min , M _w =483.2 g/mol
I.47	H	CH ₃	CH ₃	3-氯-5-(三氟甲基)-2-吡啶基	RT=2.900 min , M _w =481.6 g/mol
I.48	H	-CH=CH-CH=CH-		2-氯-4-氟基苯基	RT=2.852 min , M _w =459.6 g/mol

mp=熔點

RT=滯留時間

M_w=分子量

II. 對抗昆蟲及蜘蛛類動物之活性

一般條件

除非另作說明，否則如下製備測試溶液：將活性化合物以所要濃度溶解於1:1(vol/vol)蒸餾水：丙酮之混合物中。使用當天製備測試溶液。測試溶液通常以1000 ppm、500 ppm、300 ppm、100 ppm及30 ppm(wt/vol)之濃度製備。

II.1 棉鈴象甲 (*anthonomus grandis*)

為評估對棉鈴象甲之防治，測試裝置由含有昆蟲膳食及20-30個棉鈴象甲卵之24孔微量滴定板組成。

使用含有75% (vol/vol)之水及25% (vol/vol)之DMSO的溶液調配化合物。使用定製微型霧化器將20 μ l不同濃度之調配化合物噴灑於昆蟲膳食上，重複兩次。

施用後，在約23($\pm$ 1) $^{\circ}$ C及約50($\pm$ 5)%相對濕度下培育微量滴定板5天。隨後目測評定卵及幼蟲死亡率。

在該測試中，與未處理對照相比，2500 ppm之化合物I.9、I.12、I.17、I.18、I.25-I.28、I.33-I.35及I.38展示逾75%之死亡率。

II.2 地中海實蠅 (*ceratitis capitata*)

為評估對地中海實蠅之防治，測試裝置由含有昆蟲膳食及50-80個地中海實蠅卵之微量滴定板組成。

使用含有75% (v:v)之水及25% (v:v)之DMSO的溶液調配化合物。使用定製微型霧化器將5 μ l不同濃度之調配化合物噴灑於昆蟲膳食上，重複兩次。

施用後，在約28($\pm$ 1) $^{\circ}$ C及約80($\pm$ 5)%相對濕度下培育微量滴定板5天。隨後目測評定卵及幼蟲死亡率。

在該測試中，與未處理對照相比，2500 ppm之化合物I.9、I.12、I.17、I.25、I.27、I.33-I.35及I.38展示逾75%之死亡率。

II.3 菸芽夜蛾 (*heliothis virescens*)

為評估對菸芽夜蛾之防治，測試裝置由含有昆蟲膳食及

15-25個菸芽夜蛾卵之96孔微量滴定板組成。使用含有75% (vol/vol)之水及25% (vol/vol)之DMSO的溶液調配化合物。使用定製微型霧化器將10 μ l不同濃度之調配化合物噴灑於昆蟲膳食上，重複兩次。施用後，在約28($\pm$ 1) $^{\circ}$ C及約80($\pm$ 5)%相對濕度下培育微量滴定板5天。隨後目測評定卵及幼蟲死亡率。

在該測試中，與未處理對照相比，2500 ppm之化合物I.9、I.12、I.17、I.18、I.26、I.28、I.33-I.35及I.38展示逾75%之死亡率。

II.4 蠶豆修尾蚜(*megoura viciae*)

為評估經由接觸或全身性方式對蠶豆修尾蚜之防治，測試裝置由含有蠶豆葉盤之24孔微量滴定板組成。使用含有75% (vol/vol)之水及25% (vol/vol)之DMSO的溶液調配化合物。使用定製微型霧化器將2.5 μ l不同濃度之調配化合物噴灑於葉盤上，重複兩次。施用後，使葉盤風乾且在微量滴定板孔內之葉盤上置放5-8隻蚜蟲成蟲。隨後使蚜蟲吸於經處理之葉盤上且在約23 $\pm$ 1 $^{\circ}$ C及約50 $\pm$ 5%相對濕度下培育5天。隨後目測評定蚜蟲死亡率及繁殖率。

在該測試中，與未處理對照相比，2500 ppm之化合物I.9、I.12、I.17、I.18、I.25、I.27、I.34、I.35及I.38展示逾75%之死亡率。

II.5 桃蚜(*myzus persicae*)

為評估經由全身性方式對桃蚜之防治，測試裝置由在人工膜下含有液體人工餌料之96孔微量滴定板組成。使用含

有75% (vol/vol)之水及25% (vol/vol)之DMSO的溶液調配化合物。使用定製吸管將不同濃度之調配化合物吸移至蚜蟲餌料中，重複兩次。施用後，在微量滴定板孔內部之人工膜上置放5-8隻蚜蟲成蟲。隨後使蚜蟲吸於經處理之蚜蟲餌料上且在約 $23\pm 1^{\circ}\text{C}$ 及約 $50\pm 5\%$ 相對濕度下培育3天。隨後目測評定蚜蟲死亡率及繁殖率。

在該測試中，與未處理對照相比，2500 ppm之化合物I.9、I.12、I.17、I.18、I.26、I.27、I.34、I.35及I.38展示逾75%之死亡率。

II.6 蘭花薊馬(*dichromothrips corbetti*)

自在實驗室條件下連續維持之群落獲得用於生物檢定之蘭花薊馬成蟲。出於測試目的，在加有0.01%(vol/vol)Kinetic[®]界面活性劑之丙酮：水(vol/vol)1:1混合物中稀釋測試化合物至濃度為300 ppm(化合物重量：稀釋劑體積)。

藉由使用浸花技術評估各種化合物對薊馬之效能。使用塑膠皮氏培養皿(petri dish)作為測試台。將個別完整蘭花之所有花瓣浸入處理溶液中且容許乾燥。將經處理之花連同10-15隻薊馬成蟲一起置放於個別皮氏培養皿中。隨後用蓋子覆蓋皮氏培養皿。在檢定期間，所有測試台均保持在持續光照及約 28°C 之溫度下。4天後，計算每朵花上及沿各皮氏培養皿之內壁上之活薊馬的數目。經由預處理之薊馬數目外推薊馬死亡率之水準。

在該測試中，與未處理對照相比，300 ppm之化合物I.8-I.13、I.15、I.19、I.20、I.22、I.23、I.27及I.31展示逾75%

之死亡率。

II.7 豇豆蚜(*aphis craccivora*)

將活性化合物以所要濃度溶解於1:1(vol/vol)蒸餾水：丙酮之混合物中。使用當天製備測試溶液。

記錄害蟲總數後，噴灑經約100-150隻各階段蚜蟲定殖之盆栽豇豆植物。24、72及120小時後評定總數目減少。

在該測試中，與未處理對照相比，300 ppm之化合物I.8-I.13、I.15、I.17-I.20、I.22-I.27、I.29及I.31展示逾75%之死亡率。

II.8 棉蚜(*aphis gossypii*)I

在50:50(vol/vol)丙酮：水及100 ppm Kinetic™界面活性劑中調配活性化合物。

藉由將經主要群落重侵染之葉置放於各子葉之頂上來侵染子葉階段之棉花植物(每盆一株植物)。允許蚜蟲轉移至宿主植物隔夜，且移除用於轉移蚜蟲之葉。將子葉浸漬於測試溶液中且容許乾燥。5天後，計算死亡數。

在該測試中，與未處理對照相比，300 ppm之化合物I.5-I.20、I.22-I.25、I.28及I.31展示逾75%之死亡率。

II.9 銀葉粉虱(*bemisia argentifolii*)

在50:50丙酮：水(vol/vol)及100 ppm Kinetic™界面活性劑中調配活性化合物。

使所選擇之棉花植物生長至子葉期(每盆一株植物)。將子葉浸入測試溶液中以完全覆蓋葉片且將其置放於通風良好之區域進行乾燥。將具有經處理之種子苗之各盆置放於

塑膠杯中且將10至12隻粉虱成蟲(約3-5日齡)引入。使用抽吸器及與隔阻式吸管頭連接之Tygon[®]管收集昆蟲。隨後將含有所收集昆蟲之吸管頭輕輕插入含有經處理植物之土壤中以使昆蟲爬出吸管頭到達葉片取食。用可重複使用之篩網蓋子覆蓋杯子。使測試植物在約25℃及約20-40%相對濕度之保藏室中維持3天，避免直接曝露於螢光(24小時光週期)以防止熱量截留於杯內。處理植物後3天，評定死亡率。

在該測試中，與未處理對照相比，300 ppm化合物I.22-I.24及I.28展示逾75 %之死亡率。

II.10 馬鈴薯甲蟲(*leptinotarsa decemlineata*)

使用馬鈴薯植物進行生物檢定。將經切除之植物葉子浸入活性化合物之1:1(vol/vol)丙酮/水稀釋液中。葉子乾燥後，將其個別地置放於皮氏培養皿底上之水濕潤濾紙上。用5-7隻幼蟲侵染各培養皿且用蓋子覆蓋。重複各處理稀釋四次。將測試培養皿保持在約27℃及約60%濕度下。處理施用後5天，評定各培養皿中之活幼蟲及病態幼蟲之數目，且計算死亡百分比。

在該測試中，與未處理對照相比，300 ppm化合物I.6-I.8展示逾75%之死亡率。

II.11 桃蚜

在50:50丙酮：水(vol/vol)及100 ppm Kinetic[™]界面活性劑中調配活性化合物。

使用約40隻實驗室飼養蚜蟲、藉由將經侵染之葉切片置

放於測試植物頂上來侵染第二葉對階段之辣椒植物(變種「California Wonder」)。24小時後移除葉切片。將完整植物之葉子浸入測試化合物之梯度溶液中且容許乾燥。將測試植物維持在螢光(24小時光週期)下、約25℃及約20-40%相對濕度下。5天後，相對於對照植物上之死亡率，測定經處理植物上之蚜蟲死亡率。

在該測試中，與未處理對照相比，300 ppm之化合物I.8-I.17、I.20及I.22-I.24展示逾75%之死亡率。

II.12 黑尾葉蟬(*nephotettix virescens*)

噴灑前24小時，清潔且洗滌稻種子苗。在50:50丙酮：水(vol/vol)中調配活性化合物，且添加0.1% (vol/vol)界面活性劑(EL 620)。用5 ml測試溶液噴灑盆栽稻種子苗，風乾，置放於籠中且用10隻成蟲接種。將經處理稻植物保持在約28-29℃及約50-60%之相對濕度下。72小時後記錄死亡百分比。

在該測試中，與未處理對照相比，300 ppm化合物I.19及I.22-I.24展示逾75%之死亡率。

II.13 褐稻虱(*nilaparvata lugens*)

噴灑前24小時，清潔且洗滌稻種子苗。在50:50丙酮：水(vol/vol)中調配活性化合物，且添加0.1% (vol/vol)界面活性劑(EL 620)。用5 ml測試溶液噴灑盆栽稻種子苗，風乾，置放於籠中且用10隻成蟲接種。將經處理稻植物保持在約28-29℃及約50-60%之相對濕度下。72小時後記錄死亡百分比。

在該測試中，與未處理對照相比，300 ppm之化合物 I.9、I.11、I.13、I.15、I.22及I.23展示逾75%之死亡率。

II.14 小菜蛾(*plutella xylostella*)

將活性化合物以所要濃度溶解於1:1(vol/vol)蒸餾水：丙酮之混合物中。使用當天製備測試溶液。將大白菜葉子浸入測試溶液中且風乾。將經處理葉子置放於襯有潮濕濾紙之皮氏培養皿中。處理後24、72及120小時，記錄死亡率。亦記錄經處理幼蟲之性狀，例如活動減退及活動過度、蛹繭之存在以及死亡幼蟲之特徵。

在該測試中，與未處理對照相比，300 ppm之化合物I.8-I.13、I.15、I.19、I.20、I.22-I.24、I.27及I.31展示逾75%之死亡率。

II.15 亞熱帶黏蟲(*spodoptera eridania*，第二齡期幼蟲)

在50:50丙酮：水(vol/vol)及100 ppm Kinetic™界面活性劑中調配活性化合物。

將利馬豆(*Sieva lima bean*)之一對第一真葉浸入測試溶液中且容許乾燥。隨後將葉子置放於塑膠穿孔拉鏈封閉袋中，且添加10隻第二齡期幼蟲。第4天時，觀察死亡率及減少之饋食。

在該測試中，與未處理對照相比，300 ppm之化合物I.6-I.16、I.19、I.21-I.24及I.31展示逾75%之死亡率。

II.16 蜘蛛蟎(葉蟎屬(*tetranychus spp.*))

將活性化合物以所要濃度溶解於1:1(vol/vol)蒸餾水：丙酮之混合物中。使用當天製備測試溶液。

記錄害蟲總數後，噴灑經約50隻各階段蟎定殖之盆栽棉花植物。24、72及120小時後評定數目減少(或增加)。

在該測試中，與未處理對照相比，300 ppm之化合物I.8、I.10、I.11、I.15、I.19、I.23及I.24展示逾75%之死亡率。

III. 對抗齧齒動物之活性

本發明之一些代表性化合物已在大鼠急性口服毒性研究中測試。

在該等研究中，藉由經口強飼法向成年雌性大鼠投與測試物質一次。將化合物以1% b.w.懸浮液投與或將化合物於1%羧甲基纖維素水溶液中投與。各研究中使用3隻大鼠。用每公斤體重100 mg之單一劑量處理動物。觀察動物投藥後14天內之中毒臨床病徵(包括死亡)以鑑別可能的延遲中毒。14天觀察期後，處死動物，解剖且針對肉眼病理病變檢查。結果總結於表II中：

表 II：

化合物*	死亡率(累計)				
	0-5 h*	1 d*	2 d*	7 d*	14 d*
I.34	0	0	0	0	1
I.35	0	0	0	0	2

*處理後之時間

**根據表 I

顯然，該等化合物在其誘導中毒臨床病徵方面不同，然而，未直接或在處理後頭24小時內或24小時後觀察到該等病徵。單一經口給藥後之該延遲中毒、同時缺乏即時臨床症狀使得該等化合物適用作殺齧齒類動物劑。

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：98120300

(G/N) 417/66 (2006.01)

※ 申請日：98.6.17

※IPC 分類：A01N 43/80 (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

A01P 1/00 (2006.01)

磺醯胺化合物

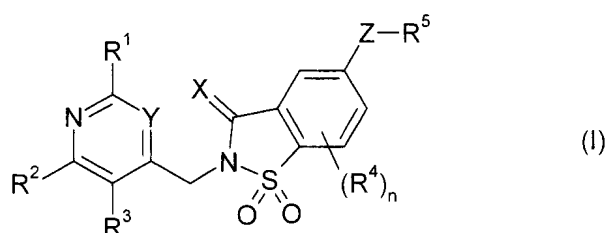
A01P 1/00 (2006.01)

SULFONAMIDE COMPOUNDS

A01P 5/00 (2006.01)

二、中文發明摘要：

本發明係關於一種式(I)磺醯胺化合物：

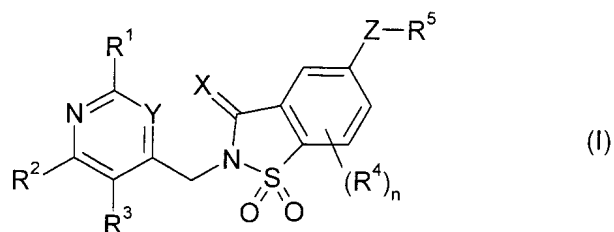


其中 R^1 為 H、鹵素、CN、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_3 - C_7 環烷基- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_2 - C_6 烯硫基、 C_2 - C_6 炔硫基、 C_1 - C_6 鹵烷基或 C_1 - C_6 鹵烷氧基； R^2 及 R^3 為 H、鹵素、CN、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_3 - C_7 環烷基- C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_2 - C_6 烯硫基、 C_2 - C_6 炔硫基、 C_1 - C_6 鹵烷基或 C_1 - C_6 鹵烷氧基；或 R^2 連同 R^3 一起形成稠合之 5 員或 6 員碳環或雜環； R^4 為鹵素、CN、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6

烷基、 C_1-C_6 烷基亞磺基、 C_1-C_6 烷基磺基、 C_1-C_6 鹵
 烷基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷硫基、 C_1-C_6 鹵烷基亞磺
 基或 C_1-C_6 鹵烷磺基； n 為0、1、2或3； R^5 為苯基或5
 員或6員雜環； X 為O或 NR^x ，其中 R^x 為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_1-C_6 烷氧基、 C_2-C_6
 烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_1-C_6 烷基羰基或 C_1-C_6 烷基羰氧
 基； Y 為N或 $C(R^y)$ ，其中 R^y 為H、鹵素、CN、 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_4
 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_2-C_6 烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_1-C_6
 烷硫基、 C_2-C_6 烯硫基、 C_2-C_6 炔硫基、 C_1-C_6 鹵烷基及 C_1-
 C_6 鹵烷氧基；且 Z 為化學鍵、O或 $N(R^z)$ ，其中 R^z 為 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_1-C_6 烷氧
 基、 C_2-C_6 烯氧基、 C_1-C_6 烷基羰基或 C_1-C_6 烷基羰氧基；
 以及其N-氧化物及鹽。該等化合物適用於對抗有害動物。
 本發明亦關於製備該等化合物之方法及該方法中所使用之
 中間化合物。本發明進一步關於一種藉由使用該等式(I)化
 合物、其N-氧化物或鹽防治有害動物的方法，植物繁殖材
 料及包含該等化合物、其N-氧化物或鹽之農業及獸醫組合
 物。

三、英文發明摘要：

The present invention relates to sulfonamide compounds of formula (I)



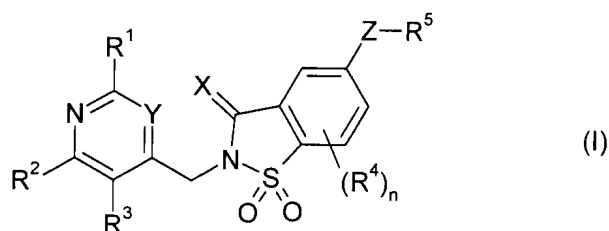
wherein R^1 is H, halogen, CN, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_7 -cycloalkyl, C_3 - C_7 -cycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_2 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_6 -alkylthio, C_2 - C_6 -alkenylthio, C_2 - C_6 -alkynylthio, C_1 - C_6 -haloalkyl or C_1 - C_6 -haloalkoxy; R^2 and R^3 are H, halogen, CN, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_7 -cycloalkyl, C_3 - C_7 -cycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_2 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_6 -alkylthio, C_2 - C_6 -alkenylthio, C_2 - C_6 -alkynylthio, C_1 - C_6 -haloalkyl or C_1 - C_6 -haloalkoxy; or R^2 together with R^3 form a fused 5 or 6-membered carbocycle or heterocycle; R^4 is halogen, CN, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_1 - C_6 -haloalkylthio, C_1 - C_6 -haloalkylsulfinyl or C_1 - C_6 -haloalkylsulfonyl; n is 0, 1, 2 or 3; R^5 is phenyl or a 5- or 6-membered heterocycle; X is O or NR^x , wherein R^x is H, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_7 -cycloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_2 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_6 -alkylcarbonyl or C_1 - C_6 -alkylcarbonyloxy; Y is N or $C(R^y)$, wherein R^y is H, halogen, CN, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_7 -cycloalkyl, C_3 - C_7 -cycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyloxy,

C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-alkylthio, C₂-C₆-alkenylthio, C₂-C₆-alkynylthio, C₁-C₆-haloalkyl and C₁-C₆-haloalkoxy; and Z is a chemical bond, O or N(R^z), wherein R^z is C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₇-cycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₁-C₆-alkylcarbonyl or C₁-C₆-alkylcarbonyloxy;

as well as to the N-oxides and salts thereof. These compounds are useful for combating animal pests. The invention also relates to a process for the preparation of these compounds and to intermediate compounds used in said process. The invention further relates to a method for controlling animal pests by using the compounds of formula (I), the N-oxides or the salts thereof, to plant propagation material and to an agricultural and veterinary composition comprising said compounds, the N-oxides or the salts thereof.

七、申請專利範圍：

1. 一種式(I)磺醯胺化合物：



其中

R^1 係選自氫、鹵素、氰基、 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_4 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_2 - C_6 烯硫基、 C_2 - C_6 炔硫基、 C_1 - C_6 鹵烷基及 C_1 - C_6 鹵烷氧基；

R^2 及 R^3 係獨立地選自氫、鹵素、氰基、 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_4 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_2 - C_6 烯硫基、 C_2 - C_6 炔硫基、 C_1 - C_6 鹵烷基及 C_1 - C_6 鹵烷氧基；或

R^2 與 R^3 連同其所結合之碳原子一起形成稠合之5員或6員碳環或含有1或2個選自O、N及S之雜原子作為環成員之稠合之5員或6員雜環，其中各稠合之碳環或雜環未經取代或具有1、2、3或4個彼此獨立地選自以下各基之取代基：鹵素、氰基、 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_4 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_1 -

C₆烷基硫基、C₂-C₆烯硫基、C₂-C₆炔硫基、C₁-C₆鹵烷基及C₁-C₆鹵烷氧基；

R⁴ 係選自鹵素、氰基、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆烷基硫基、C₁-C₆烷基亞磺基、C₁-C₆烷基磺基、C₁-C₆鹵烷基、C₁-C₆鹵烷氧基、C₁-C₆鹵烷基硫基、C₁-C₆鹵烷基亞磺基及C₁-C₆鹵烷基磺基；

n 為0、1、2或3，

R⁵ 係選自苯基及含有1、2或3個選自O、N及S之雜原子作為環成員之5員或6員雜環Het，其中苯基及Het未經取代或具有1、2、3或4個彼此獨立地選自以下各基之取代基：鹵素、氰基、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆烷基硫基、C₁-C₆烷基亞磺基、C₁-C₆烷基磺基、C₁-C₆鹵烷基、C₁-C₆鹵烷氧基、C₁-C₆鹵烷基硫基、C₁-C₆鹵烷基亞磺基及C₁-C₆鹵烷基磺基；

X 為O或NR^x，其中R^x係選自氫、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₁-C₆烷氧基、C₂-C₆烯氧基、C₁-C₆烷基羰基及C₁-C₆烷基羧基；

Y 為N或C(R^y)，其中R^y係選自氫、鹵素、氰基、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₇環烷基、C₃-C₇環烷基-C₁-C₄烷基、C₁-C₆烷氧基、C₂-C₆烯氧基、C₂-C₆炔氧基、C₁-C₆烷基硫基、C₂-C₆烯硫基、C₂-C₆炔硫基、C₁-C₆鹵烷基及C₁-C₆鹵烷氧基；且

Z 為化學鍵、O或 $N(R^Z)$ ，其中 R^Z 係選自 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_1 - C_6 烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧基、 C_1 - C_6 烷基羰基及 C_1 - C_6 烷基羰氧基；及其N-氧化物及鹽。

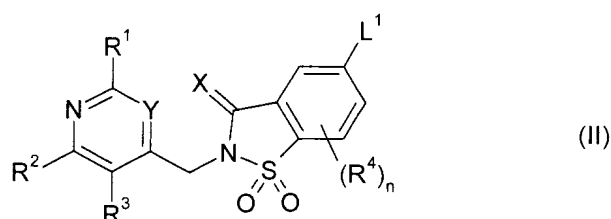
2. 如請求項1之式(I)磺醯胺化合物，其中 R^1 係選自氫、鹵素、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 鹵烷基及 C_1 - C_6 鹵烷氧基。
3. 如請求項1或2之式(I)磺醯胺化合物，其中 R^2 及 R^3 係獨立地選自氫、鹵素、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 鹵烷基及 C_1 - C_6 鹵烷氧基。
4. 如請求項1或2之式(I)磺醯胺化合物，其中 R^2 與 R^3 連同其所結合之碳原子一起形成稠合之5員或6員碳環或含有1個選自O、N及S之雜原子作為環成員之稠合之5員或6員雜環，其中各稠合之碳環或雜環未經取代或具有1個或2個彼此獨立地選自以下各基之取代基：鹵素、氰基、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 鹵烷基及 C_1 - C_6 鹵烷氧基。
5. 如請求項1或2之式(I)磺醯胺化合物，其中Y為 $C(R^Y)$ 且 R^Y 係選自氫、鹵素、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 鹵烷基及 C_1 - C_6 鹵烷氧基。
6. 如請求項1或2之式(I)磺醯胺化合物，其中X為O或NH。
7. 如請求項1或2之式(I)磺醯胺化合物，其中 R^4 係選自鹵素、 C_1 - C_4 烷基及 C_1 - C_4 鹵烷基。
8. 如請求項1或2之式(I)磺醯胺化合物，其中n為0。

9. 如請求項1或2之式(I)磺醯胺化合物，其中Z為化學鍵或O。
10. 如請求項1或2之式(I)磺醯胺化合物，其中R⁵係選自未經取代或具有1個或2個彼此獨立地選自以下各基之取代基的苯基：鹵素、C₁-C₄烷基、C₃-C₇環烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄烷基亞磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基、C₁-C₄鹵烷基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄鹵烷硫基、C₁-C₄鹵烷基亞磺醯基及C₁-C₄鹵烷基磺醯基。
11. 如請求項10之式(I)磺醯胺化合物，其中Z為化學鍵。
12. 如請求項10之式(I)磺醯胺化合物，其中R⁵係選自相對於鍵結位置在2-位置或4-位置具有1個取代基的苯基或選自相對於鍵結位置在2-位置與4-位置或2-位與5-位置具有2個取代基的苯基。
13. 如請求項1或2之式(I)磺醯胺化合物，其中R⁵係選自含有1、2或3個選自O、N及S之雜原子作為環成員之5員或6員雜環Het，其中Het未經取代或具有1個或2個彼此獨立地選自以下各基之取代基：鹵素、C₁-C₄烷基、C₃-C₇環烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄烷基亞磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基、C₁-C₄鹵烷基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄鹵烷硫基、C₁-C₄鹵烷基亞磺醯基及C₁-C₄鹵烷基磺醯基。
14. 如請求項13之式(I)磺醯胺化合物，其中Het係選自呋喃基、吡咯基、噻吩基、噁唑基、異噁唑基、吡唑基、咪唑基、噻唑基、異噻唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二

唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,2,3-三唑基、1,2,4-三唑基、吡啶基、吡嗪基、嘧啶基及噻嗪基，其中前述基團之每一者未經取代或具有1個或2個彼此獨立地選自以下各基之取代基：鹵素、 C_1 - C_4 烷基、 C_3 - C_7 環烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺基、 C_1 - C_4 烷基磺基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷基亞磺基及 C_1 - C_4 鹵烷基磺基。

15. 如請求項13之式(I)磺醯胺化合物，其中Z為O。

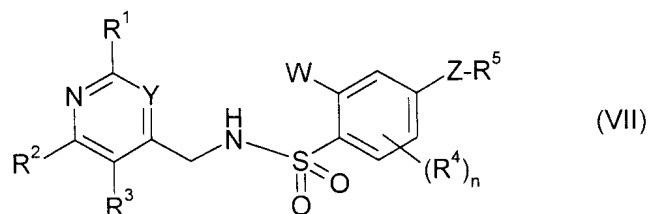
16. 一種製備如請求項1至15中任一項之式(I)磺醯胺化合物的方法，該方法包含使式(II)化合物



與式 R^5 -(Z)-B(OR^{b1})(OR^{b2})之酮酸衍生物在鹼及過渡金屬觸媒存在下反應以得到式(I)磺醯胺化合物，

其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、X、Y、Z及n如關於如請求項1至15中任一項之式(I)化合物所定義且其中 L^1 為合適的離去基且 R^{b1} 及 R^{b2} 各自獨立地為氫或 C_1 - C_4 烷基，或 R^{b1} 與 R^{b2} 一起形成碳原子可未經取代或可全部或部分經甲基取代之1,2-伸乙基部分。

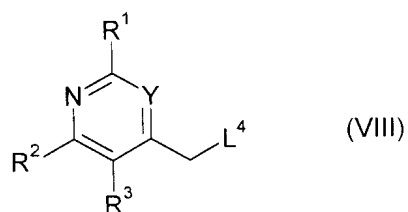
17. 一種製備如請求項1至15中任一項之式(I)磺醯胺化合物的方法，該方法包含使式(VII)化合物



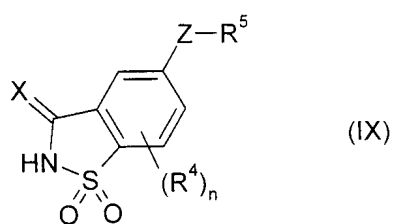
其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 Y 、 Z 及 n 如關於如請求項 1 至 15 中任一項之式 (I) 化合物所定義，且 W 為 CN 或 $-C(=O)L^2$ ，其中 L^2 為合適離去基，

進行分子內環化，得到如請求項 1 至 15 中任一項之式 (I) 化合物。

18. 一種製備如請求項 1 至 15 中任一項之式 (I) 磺醯胺化合物的方法，該方法包含使式 (VIII) 吡啶或嘧啶化合物

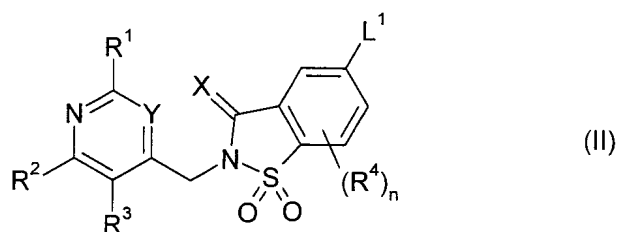


與式 (IX) 糖精或亞胺基糖精衍生物反應，



其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 X 、 Y 、 Z 及 n 如關於如請求項 1 至 15 中任一項之式 (I) 化合物所定義，且其中 L^4 為合適離去基。

19. 一種式 (II) 磺醯胺化合物，



其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 n 、 X 及 Y 具有關於如請求項 1 至 15 中任一項之式 (I) 化合物所定義之含義中之一種且其中 L^1 為鹵素。

20. 一種組合物，其含有至少一種如請求項 1 至 15 中任一項之式 (I) 磺醯胺化合物、其 N-氧化物及/或鹽及至少一種液體或固體載劑。
21. 一種防治有害動物之方法，該方法包含用如請求項 1 至 15 中任一項之式 (I) 磺醯胺化合物、其 N-氧化物及/或鹽或用如請求項 20 之組合物處理該等害蟲、其食物源、其棲息地或其滋生地或該等害蟲正生長或可生長於其中之植物、植物繁殖材料、土壤、區域、材料或環境，或欲保護以免遭害蟲侵襲或侵染之材料、植物、植物繁殖材料、土壤、表面或空間。
22. 如請求項 21 之方法，其用於保護植物繁殖材料及/或由其生長之植物，該方法包含用如請求項 1 至 15 中任一項之式 (I) 磺醯胺化合物、其 N-氧化物及/或農業上可接受之鹽或用如請求項 20 之農業組合物處理該植物繁殖材料。
23. 如請求項 21 之方法，其中該等有害動物係選自無脊椎動物害蟲。
24. 如請求項 21 之方法，其中該等有害動物係選自有害之嚙

齒動物。

25. 一種植物繁殖材料，其包含至少一種如請求項1至15中任一項之式(I)磺醯胺化合物、其N-氧化物及/或農業上可接受之鹽。
26. 一種如請求項1至15中任一項之式(I)化合物、其N-氧化物及/或獸醫學上可接受之鹽或如請求項20之組合物的用途，係用於製造供處理或保護動物以免遭寄生蟲侵染或感染之藥物。
27. 一種如請求項1至15中任一項之式(I)磺醯胺化合物、其N-氧化物及/或獸醫學上可接受之鹽或如請求項20之組合物用於防治有害動物的用途。
28. 如請求項27之用途，其中該等有害動物係選自無脊椎動物害蟲。
29. 如請求項27之用途，其中該等有害動物係選自有害之嚙齒動物。

四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：(無)

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

