



(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 201216850 A1

(43)公開日：中華民國 101 (2012) 年 05 月 01 日

(21)申請案號：100127409

(22)申請日：中華民國 100 (2011) 年 08 月 02 日

(51)Int. Cl. : A01N43/80 (2006.01)

A01N43/40 (2006.01)

(30)優先權：2010/08/03 日本

2010-174938

(71)申請人：住友化學股份有限公司 (日本) SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED

(JP)

日本

(72)發明人：井狩香織 IKARI, KAORI (JP)

(74)代理人：林志剛

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：13 項 圖式數：0 共 172 頁

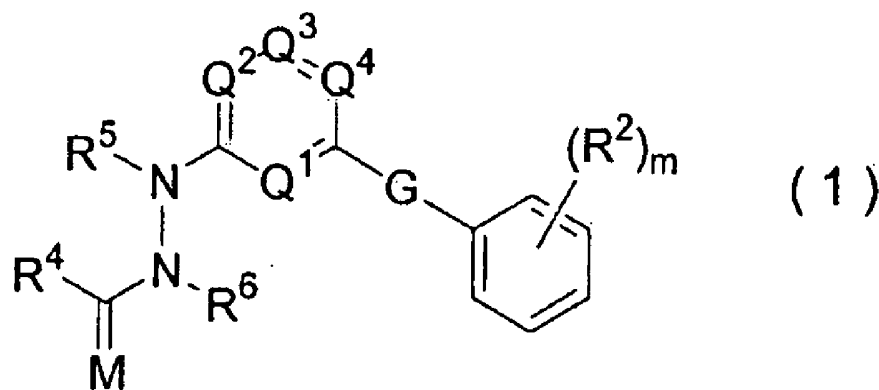
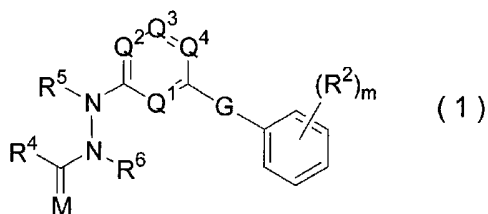
(54)名稱

防除有害生物之組成物

PEST CONTROL COMPOSITION

(57)摘要

本發明提供一種對於有害生物具有優良防除效力的組成物。本發明係為含有如下述式(1)所示醯肼化合物[式中，G、M、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、R²、R⁴、R⁵、R⁶及 m 表示如說明書所記載的意思]、與百利普芬(Pyriproxyfen)的防除有害生物之組成物；以及將下述式(1)所示醯肼化合物、與百利普芬之有效量施用於有害生物或有害生物的生息場所的有害生物防除方法。





(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 201216850 A1

(43)公開日：中華民國 101 (2012) 年 05 月 01 日

(21)申請案號：100127409

(22)申請日：中華民國 100 (2011) 年 08 月 02 日

(51)Int. Cl. : A01N43/80 (2006.01)

A01N43/40 (2006.01)

(30)優先權：2010/08/03 日本

2010-174938

(71)申請人：住友化學股份有限公司 (日本) SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED

(JP)

日本

(72)發明人：井狩香織 IKARI, KAORI (JP)

(74)代理人：林志剛

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：13 項 圖式數：0 共 172 頁

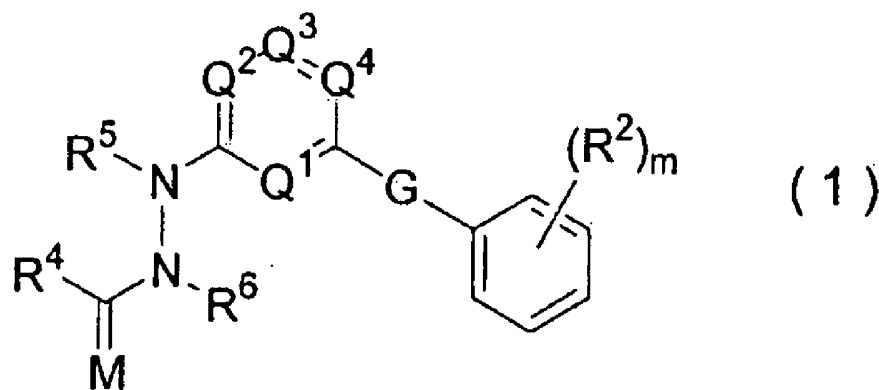
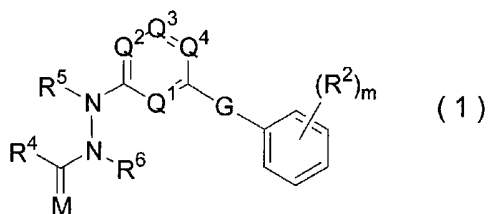
(54)名稱

防除有害生物之組成物

PEST CONTROL COMPOSITION

(57)摘要

本發明提供一種對於有害生物具有優良防除效力的組成物。本發明係為含有如下述式(1)所示醯肼化合物[式中，G、M、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、R²、R⁴、R⁵、R⁶及 m 表示如說明書所記載的意思]、與百利普芬(Pyriproxyfen)的防除有害生物之組成物；以及將下述式(1)所示醯肼化合物、與百利普芬之有效量施用於有害生物或有害生物的生息場所的有害生物防除方法。



六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於含有醯肼化合物與百利普芬之防除有害生物的組成物。

【先前技術】

含有選自 1-(四氫呋喃-3-基)甲基-3-甲基-2-硝基胍及 3-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-5-甲基-4-硝基亞胺四氫-1,3,5-噁二嗪的至少一種化合物及百利普芬之組成物對於有害節足動物具有防除效力係為已知(例如參照專利文獻 1)。

依據防除對象有時需要更優良防除效力。

[先行技術文獻]

[專利文獻]

[專利文獻 1]特開 2000-109403 號公報

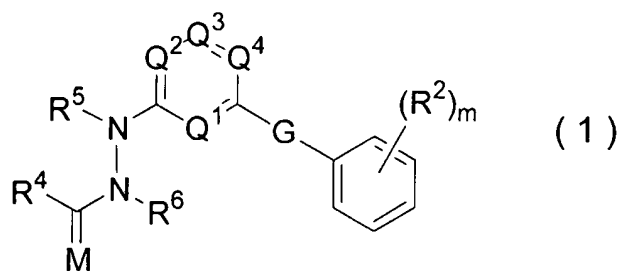
【發明內容】

解決發明之課題

本發明係以提供適用於有害生物之防除且具有優良防除效力之組成物為課題。

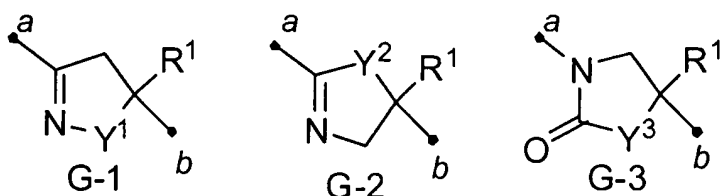
解決課題之手段

本發明者詳細檢討結果發現具有優良防除效力之組成物，發現含有下述式(1)



[式中，

G 為下述式 G-1 ~ G-3 中任一所示基



(且，點 a 及點 b 表示結合鍵，點 b 表示與苯基環之結合鍵)，

R¹ 表示 C1-C4 鹵化烷基，

Y¹ 表示氧原子、硫原子或 NR⁷ 基，

Y² 表示氧原子、硫原子、NR⁷ 基或伸甲基，

Y³ 表示氧原子、硫原子、NR⁷ 基或伸甲基，

R⁷ 表示 C1-C6 烷基、C2-C6 烯基、C2-C6 炔基、C3-C6 環烷基、C4-C7 環烷基烷基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C2-C6 烷基胺基羰基、C3-C9 二烷基胺基羰基、苯基、氰基、甲醯基或氫原子，

M 表示氧原子或硫原子，

Q¹、Q²、Q³ 及 Q⁴ 表示相同或相異之氮原子或 CR³ 基，

R³ 表示可由鹵素原子所取代之 C1-C6 烷基，可由鹵素原

子所取代之 C1-C6 烷氧基、硝基、氰基、鹵素原子或氫原子，

m 表示 0 至 5 的整數中任一，

R^2 表示可由鹵素原子所取代之 C1-C6 烷基，可由鹵素原子所取代之 C1-C6 烷氧基、C1-C6 烷基硫基、C1-C6 烷基亞磺醯基、C1-C6 烷基磺醯基、硝基、氰基或鹵素原子(但，m 為 2~5 之整數中任一時，各 R^2 為相同或相異)、

R^5 及 R^6 為相同或相異，可由選自群 E1 的基所取代之 C1-C12 鏈式烴基、可由選自群 E2 的基所取代之苯甲醯基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C3-C12 環烷基、甲醯基或氫原子，

R^4 表示可由選自群 E1 的基所取代之 C1-C12 鏈式烴基、可由選自群 E2 的基所取代之 C3-C12 環式烴基、可由選自群 E2 的基所取代之 5~6 員雜環基、 OR^8 基、 $N(R^9)R^{10}$ 基或氫原子，

R^8 表示可由選自群 E1 的基所取代之 C1-C12 鏈式烴基、可由選自群 E2 的基所取代之 C3-C12 環式烴基或可由選自群 E2 的基所取代之 5~6 員雜環基，

R^9 表示可由選自群 E1 的基所取代之 C1-C12 鏈式烴基或可由選自群 E2 的基所取代之 C3-C12 環式烴基，

R^{10} 表示可由選自群 E1 的基所取代之 C1-C12 鏈式烴基或氫原子，或 R^9 與 R^{10} 以末端結合表示 C2-C9 烷烴二基，

群 E1 表示可由選自群 E2 的基所取代之 C3-C12 環式烴基、可由選自群 E2 的基所取代之 5~6 員雜環基、可由選自

群 E2 的基所取代之苯氧基、可由選自群 E2 的基所取代之苯基胺基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C1-C6 烷氧基、C1-C6 烷基胺基、C2-C12 二烷基胺基、硝基、氰基、甲醯基及鹵素原子所成群，

群 E2 表示可由鹵素原子所取代之 C1-C6 烷基，可由鹵素原子所取代之 C1-C6 烷氧基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C1-C6 烷基胺基、C2-C12 二烷基胺基、硝基、氰基、甲醯基及鹵素原子所成群]。

所示醯肼化合物、與百利普芬的組成物對於有害生物具有優良防除效力，而完成本發明。

即，本發明係含有以下發明。

[發明 1]

含有式(1)所示醯肼化合物、與百利普芬的防除有害生物之組成物。

[發明 2]

式(1)中，G 為 G-1 所示基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為如上述定義之基，m 為 2， $(R^2)_m$ 為 3 位及 5 位之取代基， R^2 為氮原子之發明 1 所記載的防除有害生物之組成物。

[發明 3]

式(1)中， R^6 為氮原子之發明 1 或 2 所記載的防除有害生物之組成物。

[發明 4]

式(1)中， R^5 為氮原子或甲基之發明 1~3 中任一所記

載的防除有害生物之組成物。

[發明 5]

式(1)中， R^3 為鹵素原子之發明 1～4 中任一所記載的防除有害生物之組成物。

[發明 6]

式(1)中， R^3 為氮原子之發明 1～5 中任一所記載的防除有害生物之組成物。

[發明 7]

式(1)中， R^4 為 C2-C6 烷基、C1-C6 鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基之發明 1～6 中任一所記載的防除有害生物之組成物。

[發明 8]

式(1)中， R^4 為 C2-C6 烷基之發明 1～7 中任一所記載的防除有害生物之組成物。

[發明 9]

式(1)中， R^4 為 C1-C6 鹵化烷基之發明 1～7 中任一所記載的防除有害生物之組成物。

[發明 10]

式(1)中， R^4 為 C3-C6 環烷基之發明 1～7 中任一所記載的防除有害生物之組成物。

[發明 11]

式(1)中， R^4 為(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基之發明 1～7 中任一所記載的防除有害生物之組成物。

[發明 12]

將發明 1 的式 (1) 所示醯肼化合物與百利普芬的有效量，施用於有害生物或有害生物之生息場所的有害生物之防除方法。

[發明 13]

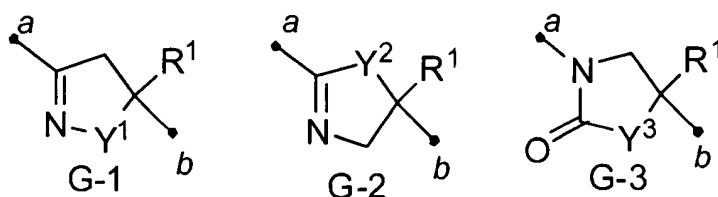
欲防除有害生物的發明 1 之式 (1) 所示醯肼化合物與百利普芬之組合的使用。

本發明的防除有害生物之組成物對於有害生物之防除具有優良效力。

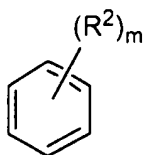
實施發明之形態

本發明的防除有害生物之組成物中，式 (1) 所示醯肼化合物 (以下記載為本醯肼化合物) 與百利普芬之重量比較佳為 5000 : 1 ~ 1 : 5000，較佳為 5000 : 1 ~ 1 : 1 之範圍內。

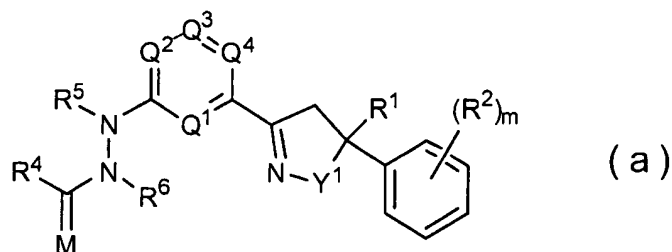
「G 表示下述式 G-1 ~ G-3 中任一所示基



(且，點 a 及點 b 表示結合鍵，點 b 表示與苯基環之結合鍵)」中之苯基環表示下述式



[式中， R^2 及 m 表示與前述相同意思]所示苯基環，
例如所謂「式(1)中， G 為 $G-1$ 所示基之醯肼化合物」表示
下述式(a)



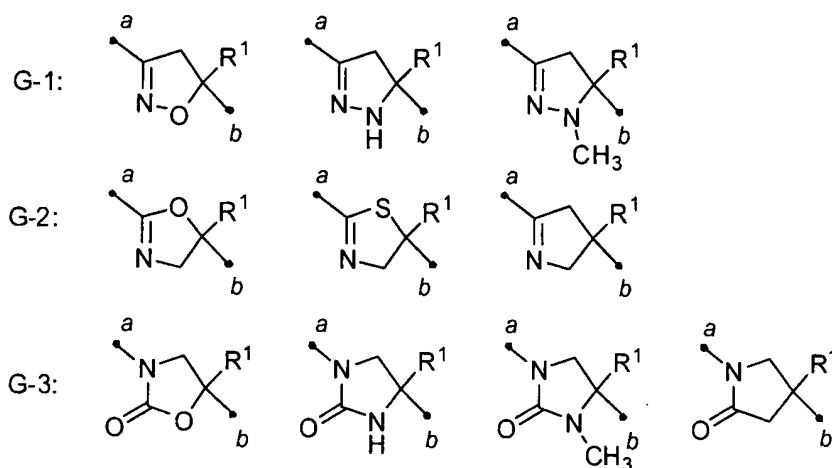
[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^1 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 M 、 Y^1 及 m 表示與前述相同意思]所示化合物。

本發明中，「鹵素原子」表示氟原子、氯原子、溴原子或碘原子的意思。

又，本說明書中，例如「C2-C6 烷基胺基羰基」所示「C2-C6」的部分記載表示構成烷基胺基羰基全體之碳原子數為 2~6 的範圍之意思。

本醯肼化合物各取代基例子如以下所示。

作為 $G-1 \sim G-3$ 中任一所示基，例如可舉出以下基。



本說明書中，

作為「C1-C4 鹵化烷基」，例如可舉出氟甲基、二氟甲基、二氯甲基、三氟甲基、氯氟甲基、溴氟甲基、氯二氟甲基、溴二氟甲基、1-氟乙基、1,1-二氟乙基、1,1,2,2,2-五氟乙基、1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基及 1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基。

作為「C1-C6 烷基」，例如可舉出甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、異丁基、sec-丁基、第三丁基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、1-乙基丙基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、2,2-二甲基丙基、己基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、1,1-二甲基丁基及 1,3-二甲基丁基。

作為「C2-C6 烯基」，例如可舉出乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基及 5-己烯基。

作為「C2-C6 炔基」，例如可舉出乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-己炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基及 5-己炔基。

作為「C3-C6 環烷基」，例如可舉出環丙基、1-甲基環丙基、2-甲基環丙基、2,2-二甲基環丙基、環丁基、環戊基、1-甲基環戊基、2-甲基環戊基、3-甲基環戊基及環

己基。

作為「C4-C7 環烷基烷基」，例如可舉出環丙基甲基、1-環丙基乙基、2-環丙基乙基、環丁基甲基、環戊基甲基及環己基甲基。

作為「C2-C6 烷基羰基」，例如可舉出乙醯基、丙醯基、丁醯基、異丁醯基及戊醯基。

作為「C2-C6 烷氧基羰基」，例如可舉出甲氧基羰基、乙氧基羰基、異丙氧基羰基、丁氧基羰基、第三丁氧基羰基及戊氧基羰基。

作為「C2-C6 烷基胺基羰基」例如可舉出 N-甲基胺基羰基、N-乙基胺基羰基、N-丙基胺基羰基、N-丁基胺基羰基及 N-戊基胺基羰基。

作為「C3-C9 二烷基胺基羰基」例如可舉出 N,N-二甲基胺基羰基及 N,N-二乙基胺基羰基。

作為「C1-C6 烷氧基」例如可舉出甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、丁氧基、異丁氧基、sec-丁氧基、第三丁氧基、戊氧基及己氧基。

作為「可由鹵素原子所取代之 C1-C6 烷基」例如可舉出甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、異丁基、sec-丁基、第三丁基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、1-乙基丙基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、2,2-二甲基丙基、己基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基等 C1-C6 烷基、氟甲基、二氟甲基、二氯甲基、三氟甲基、氯氟甲基、溴氟甲基、氯二氟

甲基、溴二氟甲基、1-氟乙基、1,1-二氟乙基、1,1,2,2,2-五氟乙基、1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基及 1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基等 C1-C6 鹵化烷基。

作為「可由鹵素原子所取代之 C1-C6 烷氧基」例如可舉出甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、丁氧基、異丁氧基、sec-丁氧基、第三丁氧基、戊氧基、己氧基等 C1-C6 烷氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯二氟甲氧基、溴二氟甲氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、1,1,2,2-四氟乙氧基、2-氯-1,1,2-三氟乙氧基、2-溴-1,1,2-三氟乙氧基、1,1,2,2,2-五氟乙氧基、2,2-二氯-1,1,2-三氟乙氧基、2,2,2-三氯-1,1-二氟乙氧基、2-溴-1,1,2,2-四氟乙氧基、2,2,3,3-四氟丙氧基、1,1,2,3,3,3-六氟丙氧基、2,2,2-三氟-1-(三氟甲基)乙氧基、1,1,2,2,3,3,3-七氟丙氧基及 2-溴-1,1,2,3,3,3-六氟丙氧基等 C1-C6 鹵化烷氧基。

作為「C1-C6 烷基硫基」例如可舉出甲基硫基、乙基硫基、丙基硫基、異丙基硫基、丁基硫基、戊基硫基及己基硫基。

作為「C1-C6 烷基亞磺醯基」例如可舉出甲亞磺醯基、乙基亞磺醯基、丙基亞磺醯基、異丙基亞磺醯基、丁基亞磺醯基、戊基亞磺醯基及己基亞磺醯基。

作為「C1-C6 烷基磺醯基」例如可舉出甲磺醯基、乙基磺醯基、丙基磺醯基、異丙基磺醯基、丁基磺醯基、戊基磺醯基及己基磺醯基。

作為「C3-C12 環烷基」例如可舉出環丙基、1-甲基環丙基、2-甲基環丙基、2,2-二甲基環丙基、2,2,3,3-四甲基環丙基、環丁基、環戊基、1-甲基環戊基、2-甲基環戊基、3-甲基環戊基、環己基、1-甲基環己基、2-甲基環己基、3-甲基環己基、4-甲基環己基、環庚基及環辛基。

作為「C2-C9 烷烴二基」，可舉出 1,2-伸乙基、1,4-四伸甲基及 1,5-五伸甲基。

作為「可由選自群 E1 的基所取代之 C1-C12 鏈式烴基」中之 C1-C12 鏈式烴基，可舉出 C1-C12 烷基、C2-C12 烯基及 C2-C12 炔基。

作為「可由選自群 E1 的基所取代之 C1-C12 鏈式烴基」例如可舉出可由選自甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、異丁基、sec-丁基、第三丁基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、1-乙基丙基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、2,2-二甲基丙基、己基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、庚基、辛基、壬基、癸基、十一烷基及十二烷基等 C1-C12 烷基；

乙烯基、1-甲基乙烯基、1-苯基乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、2-丁烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、2-戊烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、2-乙基-2-丙烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、2-己烯基、2-甲基-2-戊烯基、2,4-二甲基-2,6-庚二烯基、3,7-二甲基-2,6-辛二烯基等 C2-C12 烯基；

2-丙炔基、2-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、2-戊炔基、

1-甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基及2-己炔基等 C2-C12 炔基；

氟甲基、氯甲基、溴甲基、碘甲基、二氟甲基、氯氟甲基、二氯甲基、溴氟甲基、三氟甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氯甲基、溴二氟甲基、溴氯氟甲基、二氟碘甲基、2-氟乙基、2-氯乙基、2-溴乙基、2,2-二氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2,2-二氯乙基、2-溴-2-氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-溴-2,2-二氟乙基、1,1,2,2-四氟乙基、1,1,2,2,2-五氟乙基、1-氯-1,2,2,2-四氟乙基、2-氯-1,1,2,2-四氟乙基、1,2-二氯-1,2,2-三氟乙基、1-溴-1,2,2,2-四氟乙基、2-溴-1,1,2,2-四氟乙基、2-氟丙基、2-氯丙基、2,3-二氯丙基、3,3,3-三氟丙基、3-溴-3,3-二氟丙基、2,2,3,3-四氟丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、1,1,2,3,3,3-六氟丙基、1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基、2,3-二氯-1,1,2,3,3-五氟丙基、2-氟-1-甲基乙基、2-氯-1-甲基乙基、2-溴-1-甲基乙基、2,2,2-三氟-1-(三氟甲基)乙基、1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基及1,1,2,2,3,3,4,4,4-九氟丁基等 C1-C12 卤化烷基；

2,2-氟乙烯基、2,2-二氯乙烯基、2-氟-2-丙烯基、2-氯-2-丙烯基、3-氯-2-丙烯基、2-溴-2-丙烯基、3-溴-2-丙烯基、3,3-二氟-2-丙烯基、2,3-二氯-2-丙烯基、3,3-二氯-2-丙烯基、2,3-二溴-2-丙烯基、2,3,3-三氟-2-丙烯基、2,3,3-三氯-2-丙烯基、3-氯-2-丁烯基、3-溴-2-丁烯基、

4,4-二氟-3-丁烯基、3,4,4-三氟-3-丁烯基、3-氯-3,4,4-三氟-2-丁烯基及3-溴-2-甲基-2-丙烯基等 C2-C12 鹵烯基；

3-氯-2-丙炔基、3-溴-2-丙炔基及3-碘-2-丙炔基等 C2-C12 鹵炔基；

氰甲基等氰(C1-C12 烷基)基；

硝基甲基等 C1-C12 硝基烷基；

N,N-二甲基胺基甲基等(C2-C12 二烷基胺基)C1-C12 烷基；

N-乙基胺基甲基等(C1-C6 烷基胺基)C1-C12 烷基；

甲氧基甲基、2-甲氧基乙基、2-乙氧基乙基、2-丙氧基乙基、2-異丙氧基乙基、2-丁氧基乙基、2-異丁氧基乙基、2-(1-甲基丙氧基)乙基及2-(1,1-二甲基乙氧基)乙基等(C1-C6 烷氧基)C1-C12 烷基；

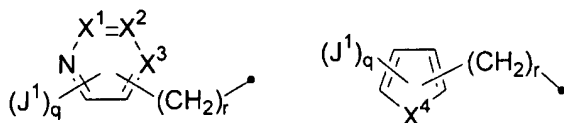
甲氧基羰基甲基、乙氧基羰基甲基、丙氧基羰基甲基、異丙氧基羰基甲基及第三丁氧基羰基甲基等(C2-C6 烷氧基羰基)C1-C12 烷基；

乙醯基甲基、2-乙醯基乙基等(C2-C6 烷基羰基)C1-C12 烷基；

苯氧基甲基、4-氯苯氧基甲基、苯氧基乙基等群 E2 的基所取代之苯氧基所取代之 C1-C12 烷基；

可由選自苯基胺基甲基、4-氯苯基胺基甲基、苯基胺基乙基等群 E2 的基所取代之苯基胺基所取代之 C1-C12 烷基；可由選自

下述式



[式中， X^1 、 X^2 及 X^3 表示 3 個皆表示 CH 基的組合，或任一 個表示氮原子且其他 2 個表示 CH 基之組合， X^4 表示氧原子、硫原子或 NH 基， r 表示 1~12 的整數， q 表示 0~3 的整數， J^1 表示可由鹵素原子所取代之 C1-C6 烷基，可由鹵素原子所取代之 C1-C6 烷氧基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C1-C6 烷基胺基、C2-C12 二烷基胺基、硝基、氰基、甲醯基或鹵素原子]。

等所示基等群 E2 的基所取代之 5~6 員雜環基所取代之 C1-C12 烷基；

可由選自苯甲基、苯乙基、4-甲基苯甲基、4-氯苯甲基、2-(環丙基)乙基及環丙基甲基等群 E2 的基所取代之 C3-C12 環式烴基所取代之 C1-C12 烷基。

作為「可由選自群 E2 的基所取代之苯甲醯基」例如可舉出苯甲醯基、2-氟苯甲醯基、3-氟苯甲醯基、4-氟苯甲醯基、2-氯苯甲醯基、3-氯苯甲醯基、4-氯苯甲醯基、2-甲氧基苯甲醯基、3-甲氧基苯甲醯基、4-甲氧基苯甲醯基、2-氰基苯甲醯基、3-氰基苯甲醯基、4-氰基苯甲醯基、2-硝基苯甲醯基、3-硝基苯甲醯基及 4-硝基苯甲醯基。

作為本醯肼化合物中之 C3-C12 環式烴基，可舉出苯基、萘基及 C3-C12 環烷基，

作為「可由選自群 E2 的基所取代之 C3-C12 環式烴基」例如可舉出苯基、2-甲基苯基、3-甲基苯基、4-甲基苯基、2-(三氟甲基)苯基、3-(三氟甲基)苯基、4-(三氟甲基)苯基、2-氟苯基、3-氟苯基、4-氟苯基、2-氯苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、2-溴苯基、3-溴苯基、4-溴苯基、2-碘苯基、3-碘苯基、4-碘苯基、2-氰苯基、3-氰苯基、4-氰苯基、2-硝基苯基、3-硝基苯基、4-硝基苯基、2-甲氧基苯基、3-甲氧基苯基、4-甲氧基苯基、2-(三氟甲氧基)苯基、3-(三氟甲氧基)苯基、4-(三氟甲氧基)苯基、2,3-二氯苯基、2,4-二氯苯基、2,5-二氯苯基、2,6-二氯苯基、3,4-二氯苯基、3,5-二氯苯基、2,3,4-三氯苯基、2,3,5-三氯苯基、3,4,5-三氯苯基、2,4,6-三氯苯基、2,3-二氟苯基、2,4-二氟苯基、2,5-二氟苯基、2,6-二氟苯基、3,4-二氟苯基、3,5-二氟苯基、3,4,5-三氟苯基、2,3,5,6-四氟苯基、2,3,4,5,6-五氟苯基、3,5-雙(三氟甲基)苯基、2,3-二甲氧基苯基、2,4-二甲氧基苯基、2,5-二甲氧基苯基、2,6-二甲氧基苯基、3,4-二甲氧基苯基、3,5-二甲氧基苯基、4-甲氧基羰基苯基及 4-乙氧基羰基苯基等苯基；

環丙基、1-甲基環丙基、2-甲基環丙基、2,2-二甲基環丙基、2,2,3,3-四甲基環丙基、環丁基、環戊基、1-甲基環戊基、2-甲基環戊基、3-甲基環戊基、環己基、1-甲基環己基、2-甲基環己基、3-甲基環己基、4-甲基環己基、環庚基及環辛基等 C3-C12 環烷基。

作為「可由選自群 E2 的基所取代之 5~6 員雜環基」

中之 5~6 員雜環基，可舉出四氫呋喃基、呋喃基、噻吩基、吡咯基、咪唑基、異噻唑基等氧原子、硫原子及/或氮原子為雜原子之 5 員雜環基；

六氫吡啶基、嗎啉代基、吡啶基、噻嗪基、嘧啶基、吡嗪基等氧原子、硫原子及/或氮原子為雜原子之 6 員雜環基，

作為「可由選自群 E2 的基所取代之 5~6 員雜環基」，可舉出 1-吡咯基、2-吡咯基、3-吡咯基、2-呋喃基、3-呋喃基、2-噻吩基、3-噻吩基、1-吡唑基、3-吡唑基、4-吡唑基、3-異噁唑基、4-異噁唑基、5-異噁唑基、3-異噻唑基、4-異噻唑基、5-異噻唑基、1-咪唑基、2-咪唑基、4-咪唑基等、2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基等、2-噻唑基、4-噻唑基、5-噻唑基、1,2,4-三唑-1-基、1,2,4-三唑-3-基、1,3,4-噁二唑-2-基、1,3,4-噻二唑-2-基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1-吡咯烷基、2-吡咯烷基、3-吡咯烷基、2-四氫呋喃基、3-四氫呋喃基、1-六氫吡啶基、1-嗎啉代基、2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、3-噻嗪基、4-噻嗪基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、5-嘧啶基、2-吡嗪基、1,2,4-三嗪-3-基、1,2,4-三嗪-5-基及 1,2,4-三嗪-6-基、1,3,5-三嗪-2-基。

作為「C1-C6 烷基胺基」，可舉出 N-甲基胺基、N-乙基胺基、N-丙基胺基、N-丁基胺基及 N-戊基胺基。

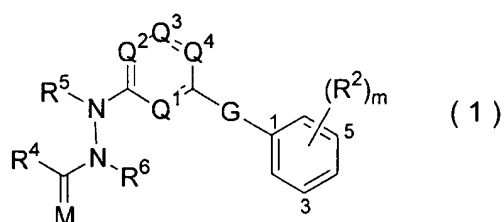
作為「C2-C12 二烷基胺基」例如可舉出 N,N-二甲基

胺基及 N,N-二乙基胺基。

作為上述 OR^8 基，例如可舉出甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、丁氧基、異丁氧基、sec-丁氧基、第三丁氧基、乙烯氧基、烯丙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、氰甲氧基、2-(N,N-二甲基胺基)乙氧基、2-(N-甲基胺基)乙氧基、2-甲氧基乙氧基、甲氧基羰基甲氧基、乙醯基甲氧基、2-苯氧基乙氧基、2-(苯基胺基)乙氧基、2-吡啶氧基、苯甲氧基、苯氧基、環己氧基、呋喃-2-氧基、吡啶-2-氧基等。

作為上述 $N(R^9)R^{10}$ 基，例如可舉出 N-甲基胺基、N,N-二甲基胺基、N-乙基胺基、N,N-二乙基胺基、N-甲基-N-乙基胺基、N-丙烯胺基、N-(2,2,2-三氟乙基)胺基、N-(2-(N,N-二甲基胺基)乙基)胺基、N-(2-(N-甲基胺基)乙基)胺基、N-(2-甲氧基乙基)胺基、N-(甲氧基羰基甲基)胺基、N-(2-苯氧基乙基)胺基、N-(2-(苯基胺基)乙基)胺基、N-苯甲胺基、N-苯基胺基、N-苯基-N-甲基胺基、N-環己基胺基、N-環己基-N-甲基胺基、吡咯烷-1-基、六氫吡啶-1-基等。

作為本醯肼化合物之態樣，例如可舉出以下醯肼化合物。



式(1)中，G 爲 G-1 所示基之醯肼化合物；

式(1)中，G 爲 G-1 所示基， Y^1 爲氧原子之醯肼化合物；

式(1)中， R^1 爲三氟甲基之醯肼化合物；

式(1)中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 爲 CH 基之醯肼化合物；

式(1)中， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 爲 CH 基， Q^2 爲 CR^3 基， R^3 爲上述定義者之醯肼化合物；

式(1)中， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 爲 CH 基， Q^2 爲 CR^3 基， R^3 爲 C1-C6 烷基之醯肼化合物；

式(1)中， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 爲 CH 基， Q^2 爲 CR^3 基， R^3 爲甲基之醯肼化合物；

式(1)中， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 爲 CH 基， Q^2 爲 CR^3 基， R^3 爲乙基之醯肼化合物；

式(1)中， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 爲 CH 基， Q^2 爲 CR^3 基， R^3 爲鹵素原子之醯肼化合物；

式(1)中， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 爲 CH 基， Q^2 爲 CR^3 基， R^3 爲氟原子之醯肼化合物；

式(1)中， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 爲 CH 基， Q^2 爲 CR^3 基， R^3 爲氯原子之醯肼化合物；

式(1)中， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 爲 CH 基， Q^2 爲 CR^3 基， R^3 爲溴原子之醯肼化合物；

式(1)中，m 爲 2， R^2 爲各鹵素原子之醯肼化合物；式(1)中，m 爲 2， R^2 爲各氯原子之醯肼化合物；

式(1)中，m 爲 2， $(R^2)_m$ 爲 3 位及 5 位之取代基， R^2

為各氮原子之醯肼化合物；

式(1)中， R^4 為可由選自群 E1 的基所取代之 C1-C12 鏈式烴基之醯肼化合物；

式(1)中， R^4 為可由選自群 E2 的基所取代之 C3-C12 環式烴基之醯肼化合物；

式(1)中， R^4 為可由選自群 E2 的基所取代之 5~6 員雜環基之醯肼化合物；

式(1)中， R^4 為 OR^8 基， R^8 為上述定義者之醯肼化合物；

式(1)中， R^4 為 $N(R^9)R^{10}$ 基， R^9 及 R^{10} 為上述定義者之醯肼化合物；

式(1)中， R^5 為氫原子之醯肼化合物；

式(1)中， R^5 為可由選自群 E1 的基所取代之 C1-C12 鏈式烴基之醯肼化合物；

式(1)中， R^5 為甲基之醯肼化合物；

式(1)中， R^5 為 C2-C6 烷氧基羰基之醯肼化合物；

式(1)中， R^5 為 C2-C6 烷基羰基之醯肼化合物；式(1)中， R^5 為乙醯基之醯肼化合物；

式(1)中， R^5 為可由選自群 E2 的基所取代之苯甲醯基之醯肼化合物；

式(1)中， R^5 為苯甲醯基之醯肼化合物；

式(1)中， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1)中， R^6 為可由選自群 E1 的基所取代之 C1-C12 鏈式烴基之醯肼化合物；

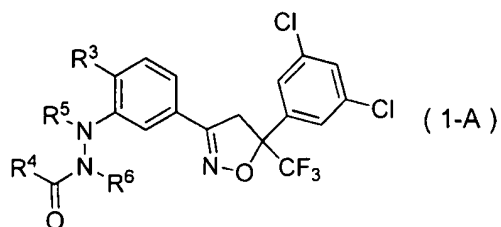
式(1)中， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1)中， G 為 $G-1$ 所示基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基之醯肼化合物；

式(1)中， G 為 $G-1$ 所示基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基之醯肼化合物；

式(1)中， G 為 $G-1$ 所示基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為上述定義的基之醯肼化合物；

式(1)中， G 為 $G-1$ 所示基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為上述定義的基， m 為 2， $(R^2)_m$ 為 3 位及 5 位之取代基， R^2 為各氮原子之下式(1-A)所示醯肼化合物；



式(1-A)中， R^3 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為乙基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氟原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氯原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為溴原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^5 為氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^5 為甲基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物

；

式 (1-A) 中， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^5 為甲基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^3 為鹵素原子， R^5 為氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^3 為鹵素原子， R^5 為甲基之醯肼化合物

；

式 (1-A) 中， R^3 為鹵素原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^3 為鹵素原子， R^6 為甲基之醯肼化合物

；

式 (1-A) 中， R^3 為氮原子， R^5 為氫原子之醯肼化合物

；

式 (1-A) 中， R^3 為氮原子， R^5 為甲基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^3 為氮原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物

；

式 (1-A) 中， R^3 為氮原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^3 為氮原子， R^5 為氮原子， R^6 為氮原子

之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為甲基， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為乙基， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氟原子， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氯原子， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為溴原子， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氫原子， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為甲基， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為乙基， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氟原子， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氯原子， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之

醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為溴原子， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氫原子， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為甲基， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為乙基， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氟原子， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氯原子， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為溴原子， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氫原子， R^5 為甲基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為甲基， R^5 為甲基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為乙基， R^5 為甲基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^5 為甲基， R^6 為甲基之

醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氟原子， R^5 為甲基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氯原子， R^5 為甲基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為溴原子， R^5 為甲基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 C2-C6 烷基、C1-C6 鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 C2-C6 烷基、C1-C6 鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基， R^5 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 C2-C6 烷基、C1-C6 鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基， R^5 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 C2-C6 烷基、C1-C6 鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 C2-C6 烷基、C1-C6 鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 C2-C6 烷基、C1-C6 鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為 C1-C6 烷基、鹵素原子或氫原子， R^4 為 C2-C6 烷基、C1-C6 鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為 C1-C6 烷基、鹵素原子或氫原子， R^4 為 C2-C6 烷基、C1-C6 鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基， R^5 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為 C1-C6 烷基、鹵素原子或氫原子， R^4 為 C2-C6 烷基、C1-C6 鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基， R^5 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為 C1-C6 烷基、鹵素原子或氫原子， R^4 為 C2-C6 烷基、C1-C6 鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為 C1-C6 烷基、鹵素原子或氫原子， R^4 為 C2-C6 烷基、C1-C6 鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為 C1-C6 烷基、鹵素原子或氫原子， R^4 為 C2-C6 烷基、C1-C6 鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氫原子， R^4 為 C2-C6 烷基、C1-C6 鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氫原子， R^4 為 C2-C6 烷基、C1-C6

鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基，
R⁵ 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中，R³ 為氯原子，R⁴ 為 C2-C6 烷基、C1-C6 鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基，
R⁵ 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中，R³ 為氯原子，R⁴ 為 C2-C6 烷基、C1-C6 鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基，
R⁶ 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中，R³ 為氯原子，R⁴ 為 C2-C6 烷基、C1-C6 鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基，
R⁵ 為氫原子，R⁶ 為氫原子之醯肼化合物；式(1-A)中，R³ 為氯原子，R⁴ 為 C2-C6 烷基、C1-C6 鹵化烷基、C3-C6 環烷基或(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基，R⁵ 為甲基，R⁶ 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中，R⁴ 為 C1-C6 烷基之醯肼化合物；

式(1-A)中，R⁴ 為 C2-C6 烷基之醯肼化合物；

式(1-A)中，R⁴ 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中，R⁴ 為乙基之醯肼化合物；

式(1-A)中，R⁴ 為丙基之醯肼化合物；

式(1-A)中，R⁴ 為異丙基之醯肼化合物；

式(1-A)中，R⁴ 為丁基之醯肼化合物；

式(1-A)中，R⁴ 為第三丁基之醯肼化合物；

式(1-A)中，R⁴ 為 2-甲基丙基之醯肼化合物；

式(1-A)中，R⁴ 為戊基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 爲鹵素原子， R^4 爲 C2-C6 烷基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 爲鹵素原子， R^4 爲 C2-C6 烷基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 爲鹵素原子， R^4 爲 C2-C6 烷基， R^5 爲氫原子， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 爲鹵素原子， R^4 爲 C2-C6 烷基， R^5 爲甲基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 爲氯原子， R^4 爲 C2-C6 烷基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 爲氯原子， R^4 爲 C2-C6 烷基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 爲氯原子， R^4 爲 C2-C6 烷基， R^5 爲氫原子， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 爲氯原子， R^4 爲 C2-C6 烷基， R^5 爲甲基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲甲基， R^5 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲甲基， R^5 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲甲基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲甲基， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲甲基， R^5 爲氫原子， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲甲基， R^5 爲甲基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 爲甲基， R^5 爲氫原子， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 爲甲基， R^5 爲甲基， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 爲乙基， R^5 爲氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 爲乙基， R^5 爲甲基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 爲乙基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 爲乙基， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 爲乙基， R^5 爲氫原子， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 爲乙基， R^5 爲甲基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 爲乙基， R^5 爲氫原子， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 爲乙基， R^5 爲甲基， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 爲丙基， R^5 爲氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 爲丙基， R^5 爲甲基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 爲丙基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 爲丙基， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 爲丙基， R^5 爲氫原子， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 爲丙基， R^5 爲甲基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為丙基， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為丙基， R^5 為甲基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為異丙基， R^5 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為異丙基， R^5 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為異丙基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為異丙基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為異丙基， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為異丙基， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為異丙基， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為異丙基， R^5 為甲基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為丁基， R^5 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為丁基， R^5 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為丁基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為丁基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為丁基， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲丁基， R^5 爲甲基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲丁基， R^5 爲氫原子， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲丁基， R^5 爲甲基， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲第三丁基， R^5 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲第三丁基， R^5 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲第三丁基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲第三丁基， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲第三丁基， R^5 爲氫原子， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲第三丁基， R^5 爲甲基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲第三丁基， R^5 爲氫原子， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲第三丁基， R^5 爲甲基， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲 2-甲基丙基， R^5 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲 2-甲基丙基， R^5 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲 2-甲基丙基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲 2-甲基丙基， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲 2-甲基丙基， R^5 爲氫原子， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲 2-甲基丙基， R^5 爲甲基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲 2-甲基丙基， R^5 爲氫原子， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲 2-甲基丙基， R^5 爲甲基， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲戊基， R^5 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲戊基， R^5 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲戊基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲戊基， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲戊基， R^5 爲氫原子， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲戊基， R^5 爲甲基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲戊基， R^5 爲氫原子， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲戊基， R^5 爲甲基， R^6 爲甲基之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲 C1-C6 鹵化烷基之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲 C1-C6 氟烷基之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲 2,2,2-三氟乙基之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲 3,3,3-三氟丙基之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲 4,4,4-三氟丁基之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^3 爲鹵素原子， R^4 爲 C1-C6 氟烷基之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^3 爲鹵素原子， R^4 爲 2,2,2-三氟乙基之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^3 爲鹵素原子， R^4 爲 3,3,3-三氟丙基之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^3 爲鹵素原子， R^4 爲 4,4,4-三氟丁基之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^3 爲鹵素原子， R^4 爲 C1-C6 氟烷基， R^5 爲氫原子之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^3 爲鹵素原子， R^4 爲 C1-C6 氟烷基， R^5 爲甲基之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^3 爲鹵素原子， R^4 爲 C1-C6 氟烷基， R^6 爲氫原子之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^3 爲鹵素原子， R^4 爲 C1-C6 氟烷基， R^6 爲甲基之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^3 爲鹵素原子， R^4 爲 C1-C6 氟烷基， R^5

為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^4 為 C1-C6 氟烷基， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氫原子， R^4 為 C1-C6 氟烷基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氫原子， R^4 為 2,2,2-三氟乙基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氫原子， R^4 為 3,3,3-三氟丙基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氫原子， R^4 為 4,4,4-三氟丁基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氫原子， R^4 為 C1-C6 氟烷基， R^5 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氫原子， R^4 為 C1-C6 氟烷基， R^5 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氫原子， R^4 為 C1-C6 氟烷基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氫原子， R^4 為 C1-C6 氟烷基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氫原子， R^4 為 C1-C6 氟烷基， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氫原子， R^4 為 C1-C6 氟烷基， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 2,2,2-三氟乙基， R^5 為氫原子之醯

肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 2,2,2-三氟乙基， R^5 為甲基之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 2,2,2-三氟乙基， R^6 為氫原子之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 2,2,2-三氟乙基， R^6 為甲基之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 2,2,2-三氟乙基， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 2,2,2-三氟乙基， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 2,2,2-三氟乙基， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 2,2,2-三氟乙基， R^5 為甲基， R^6 為甲基之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 3,3,3-三氟丙基， R^5 為氫原子之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 3,3,3-三氟丙基， R^5 為甲基之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 3,3,3-三氟丙基， R^6 為氫原子之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 3,3,3-三氟丙基， R^6 為甲基之鹽肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 3,3,3-三氟丙基， R^5 為氫原子， R^6

為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 3,3,3-三氟丙基， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 3,3,3-三氟丙基， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 3,3,3-三氟丙基， R^5 為甲基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 4,4,4-三氟丁基， R^5 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 4,4,4-三氟丁基， R^5 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 4,4,4-三氟丁基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 4,4,4-三氟丁基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 4,4,4-三氟丁基， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 4,4,4-三氟丁基， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 4,4,4-三氟丁基， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 4,4,4-三氟丁基， R^5 為甲基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為 C3-C6 環烷基之醯肼化合物；式(1-

A)中， R^4 為環丙基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為環丁基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為環戊基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為環己基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^4 為環丙基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^4 為環丙基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^4 為環丁基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^4 為環丁基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^4 為環戊基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^4 為環戊基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^4 為環己基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^4 為環己基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氯原子， R^4 為環丙基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氯原子， R^4 為環丙基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^3 為氯原子， R^4 為環丁基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^3 為氯原子， R^4 為環丁基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^3 為氯原子， R^4 為環戊基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^3 為氯原子， R^4 為環戊基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^3 為氯原子， R^4 為環己基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^3 為氯原子， R^4 為環己基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 為環丙基， R^5 為氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 為環丙基， R^5 為甲基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 為環丙基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 為環丙基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 為環丙基， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 為環丙基， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式 (1-A) 中， R^4 為環丙基， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲環丙基， R^5 爲甲基， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲環丁基， R^5 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲環丁基， R^5 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲環丁基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲環丁基， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲環丁基， R^5 爲氫原子， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲環丁基， R^5 爲甲基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲環丁基， R^5 爲氫原子， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲環丁基， R^5 爲甲基， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲環戊基， R^5 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲環戊基， R^5 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲環戊基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲環戊基， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲環戊基， R^5 爲氫原子， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為環戊基， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為環戊基， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為環戊基， R^5 為甲基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為環己基， R^5 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為環己基， R^5 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為環己基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為環己基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為環己基， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為環己基， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為環己基， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為環己基， R^5 為甲基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為(C1-C6 烷氧基)C1-C6 烷基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為甲氧基甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲乙氧基甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲(C1-C6 烷氧基)甲基， R^5 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲(C1-C6 烷氧基)甲基， R^5 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲(C1-C6 烷氧基)甲基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲(C1-C6 烷氧基)甲基， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲(C1-C6 烷氧基)甲基， R^5 爲氫原子， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲(C1-C6 烷氧基)甲基， R^5 爲甲基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲(C1-C6 烷氧基)甲基， R^5 爲氫原子， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲(C1-C6 烷氧基)甲基， R^5 爲甲基， R^6 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲甲氧基甲基， R^5 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲甲氧基甲基， R^5 爲甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲甲氧基甲基， R^6 爲氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 爲甲氧基甲基， R^6 爲甲基之醯肼化合物

物；

式(1-A)中， R^4 為甲氧基甲基， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為甲氧基甲基， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為甲氧基甲基， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^4 為甲氧基甲基， R^5 為甲基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲基， R^5 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲基， R^5 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲基， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲基， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲

基， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為鹵素原子， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲基， R^5 為甲基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氮原子， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氮原子， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲基， R^5 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氮原子， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲基， R^5 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氮原子， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氮原子， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲基， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氮原子， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲基， R^5 為氫原子， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氮原子， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲基， R^5 為甲基， R^6 為氫原子之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氮原子， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲基， R^5 為氫原子， R^6 為甲基之醯肼化合物；

式(1-A)中， R^3 為氮原子， R^4 為(C1-C6 烷氧基)甲基， R^5 為甲基， R^6 為甲基之醯肼化合物。

作為本發明的防除有害生物之組成物的態樣，例如可舉出以下者。

含有選自後述製造例所示之本醯肼化合物(1)～(63)所

成群之 1 種醯肼化合物與百利普芬之組成物；

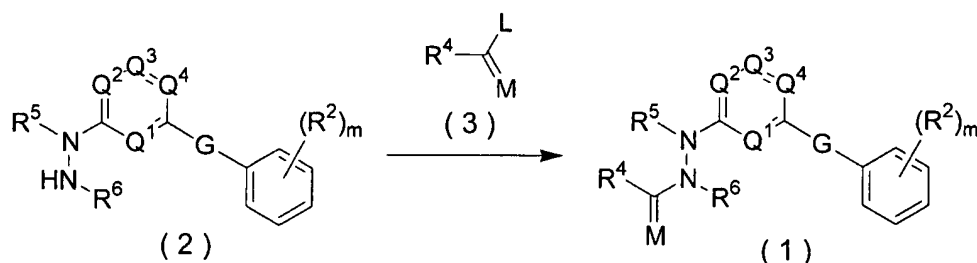
將含有選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群之 1 種醯肼化合物與百利普芬，其中以醯肼化合物：百利普芬=5000：1~1：5000，較佳為 5000：1~1：1 的重量比含有之組成物。

其次對於本醯肼化合物的製造做以下說明。

以下有時將式(α)所示化合物以「化合物(α)」所示。

(製造法 1)

本醯肼化合物可藉由反應化合物(2)與化合物(3)而製造。



[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 G 、 M 及 m 表示與前述相同意思， L 表示羥基或氯原子]

該反應在一般溶劑中進行。

作為使用於反應的溶劑，例如可舉出四氫呋喃、二乙基醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚、1,4-二噁烷等醚類、 N,N -二甲基甲醯胺等酸醯胺類、乙腈等腈類、甲苯、二甲苯等芳香族烴類、乙酸乙酯等酯類、二甲基亞砷等亞砷類、環丁砷；1,2-二氯乙烷、氯仿、氯苯等鹵化烴類

及彼等混合物。

L 爲氮原子時，該反應一般在鹼存在下進行。

作爲使用於該反應之鹼，例如可舉出氫化鈉等鹼金屬氫化物類、碳酸鉀等碳酸鹽類、第三丁氧化鉀等鹼金屬烷氧化物類及三乙基胺、吡啶等有機胺類。

L 爲羥基時，該反應在縮合劑存在下進行。

作爲使用於該反應之縮合劑，例如可舉出二環己基碳二亞胺及 1-(3-二甲基胺基丙基)-3-乙基碳二亞胺鹽酸鹽。

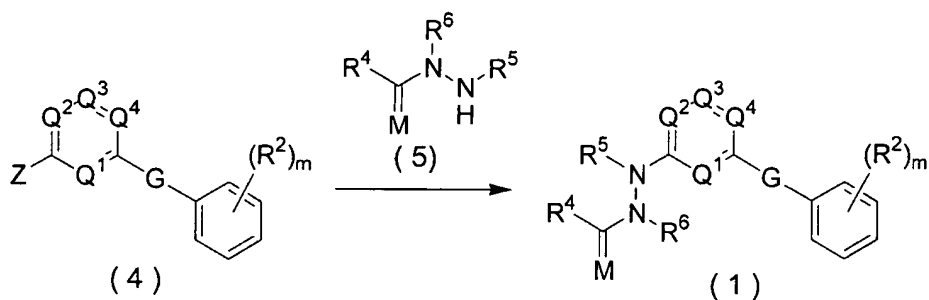
使用於反應之試劑的量對於化合物(2)1 莫耳而言，化合物(3)一般爲 1~10 莫耳之比率，鹼或縮合劑一般爲 1~10 莫耳之比率。

該反應的反應溫度一般爲 0~100℃之範圍，反應時間一般爲 0.5~24 小時的範圍。

反應終了後，將反應混合物藉由進行有機溶劑萃取，乾燥、濃縮等後處理操作，可分離本醯肼化合物。經分離的本醯肼化合物可藉由層析、再結晶等做進一步純化。

(製造法 2)

本醯肼化合物亦可藉由反應化合物(4)與化合物(5)而製造。



[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 G 、 M 及 m 表示與前述相同意思， Z 表示氟原子、氯原子、溴原子、碘原子、甲烷磺醯氧基、 p -甲苯磺醯氧基及三氟甲烷磺醯氧基等脫離基]。

該反應在一般溶劑中進行。

作為使用於反應之溶劑，例如可舉出四氫呋喃、二乙基醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚、1,4-二噁烷等醚類、 N,N -二甲基甲醯胺等酸醯胺類、乙腈等腈類、甲苯、二甲苯等芳香族烴類、乙酸乙酯等酯類、二甲基亞砷等亞砷類、環丁砷；1,2-二氯乙烷、氯仿、氯苯等鹵化烴類及彼等混合物。

該反應若必要可在鹼存在下進行。

作為使用於該反應之鹼，例如可舉出氫化鈉等鹼金屬氫化物類、碳酸鉀等碳酸鹽類、第三丁氧化鉀等鹼金屬烷氧化物類及三乙基胺、吡啶等有機胺類。

使用於反應之試劑量，對於式(4)所示化合物 1 莫耳而言，式(5)所示化合物一般為 1~5 莫耳的比率，鹼一般為 1~5 莫耳的比率。

該反應之反應溫度一般為 0~100℃之範圍，反應時間

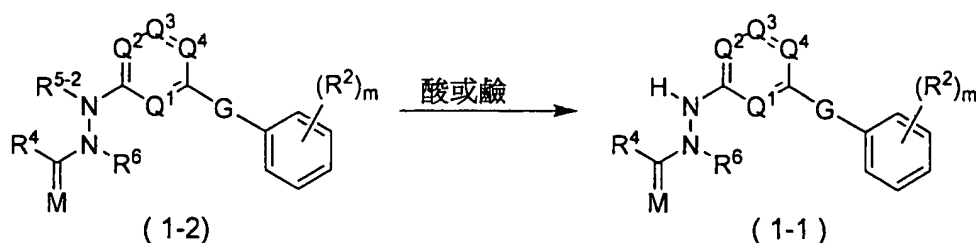
一般為 0.1~24 小時的範圍。

反應終了後，反應混合物藉由進行有機溶劑萃取、乾燥、濃縮等後處理操作，可分離本醯肼化合物。經分離之本醯肼化合物可藉由層析、再結晶等進一步純化。

又，該反應可為使用文獻記載的一般過渡金屬觸媒的偶合反應，例如亦可依據 Org. Lett., 3, 3803-3805(2001) 所記載的反應條件進行。

(製造法 3)

本醯肼化合物中， R^5 為氫原子之化合物 (1-1) 亦可藉由將本醯肼化合物中 R^5 為 R^{5-2} 的化合物 (1-2) 與酸或鹼進行反應而製造。



[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^4 、 R^6 、 G 、 M 及 m 表示與前述相同意思， R^{5-2} 表示可由選自群 E2 的基所取代之苯甲醯基、C2-C6 烷基羰基或 C2-C6 烷氧基羰基]。

該反應若必要可使用溶劑進行。

作為該溶劑，例如可舉出水、四氫呋喃、二乙基醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚、1,4-二噁烷等醚；、 N,N -二甲基甲醯胺等酸醯胺；乙腈等腈類、甲苯、二甲苯

等芳香族烴；乙酸乙酯等酯類、二甲基亞碲等亞碲；環丁碲；1,2-二氯乙烷、氯仿、氯苯等鹵化烴；甲醇、乙醇、n-丙醇等醇類；及彼等混合物。

作為該酸，例如可舉出乙酸、三氟乙酸等有機酸類；鹽酸、溴化氫酸、硫酸等無機酸類。

作為該鹼，例如可舉出氫化鈉等鹼金屬氫化物類、碳酸鉀等碳酸鹽；第三丁氧化鉀等鹼金屬烷氧化物類及三乙胺、吡啶等有機胺。

上述酸對於化合物(1-2)1莫耳而言，一般使用1~100莫耳之量。

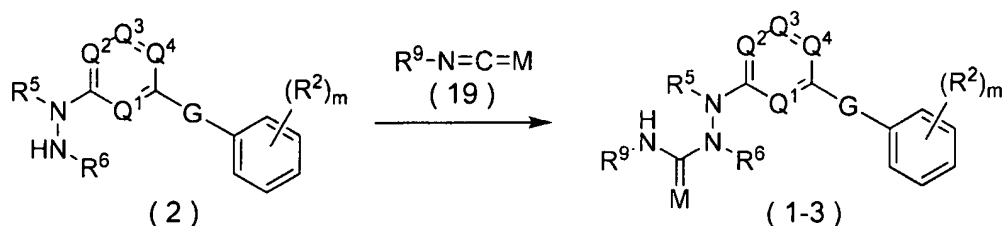
上述鹼對於化合物(1-2)1莫耳而言，一般使用1~100莫耳的量。

反應溫度一般為0~100℃的範圍，反應時間一般為0.1~24小時的範圍。

反應終了後，反應混合物可藉由進行有機溶劑萃取、乾燥、濃縮等後處理操作，分離本醯肼化合物。經分離之本醯肼化合物可藉由層析、再結晶等進一步純化。

(製造法 4)

本醯肼化合物中， R^4 為 $N(R^9)R^{10}$ 基， R^{10} 為氫原子之化合物(1-3)亦可藉由反應化合物(2)與化合物(19)而製造。



[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^5 、 R^6 、 R^9 、 G 、 M 及 m 表示與前述相同意思]。

該反應在一般溶劑中進行。若必要亦可在鹼存在下進行反應。

作為該溶劑，例如可舉出四氫呋喃、二乙基醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚、1,4-二噁烷等醚；N,N-二甲基甲醯胺等酸醯胺；乙腈等腈類、甲苯、二甲苯等芳香族烴；乙酸乙酯等酯類、二甲基亞砷等亞砷；環丁砷；1,2-二氯乙烷、氯仿、氯苯等鹵化烴；及彼等混合物。

作為上述鹼，可舉出碳酸鉀、碳酸鈉等碳酸鹽；三乙胺、吡啶、4-(二甲基胺基)吡啶、咪唑、1,8-二吡雙環[5,4,0]-7-十一烯等有機胺。

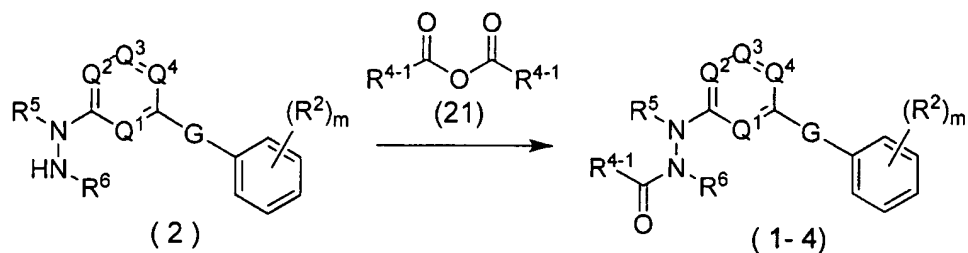
對於上述反應，化合物(19)對於化合物(2)1莫耳而言，一般使用1~5莫耳的量。若上述鹼的添加為必要時，對於化合物(2)1莫耳而言，一般可使用1~5莫耳的量。

反應溫度一般為0~100℃的範圍，反應時間一般為0.1~24小時的範圍。

反應終了後，反應混合物可藉由進行有機溶劑萃取、乾燥、濃縮等後處理操作，分離本醯肼化合物。經分離之本醯肼化合物可藉由層析、再結晶等進一步純化。

(製造法 5)

本醯肼化合物中， R^4 爲 R^{4-1} ， M 爲氧原子之化合物
(1-4)亦可藉由反應化合物(2)與化合物(21)而製造。



[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^5 、 R^6 、 G 、及 m 表示與前述相同意思， R^{4-1} 表示可由選自群 E1 的基所取代之 C1-C12 鏈式烴基、可由選自群 E2 的基所取代之 C3-C12 環式烴基、可由選自群 E2 的基所取代之 5~6 員雜環基或 OR^8 基， R^8 表示與前述相同意思]。

該反應若必要可使用溶劑進行。

作為該溶劑，例如可舉出四氫呋喃、二乙基醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚、1,4-二噁烷等醚；N,N-二甲基甲醯胺等酸醯胺；乙腈等腈；甲苯、二甲苯等芳香族烴；乙酸乙酯等酯；二甲基亞砷等亞砷；環丁砷；1,2-二氯乙烷、氯仿、氯苯等鹵化烴；及彼等混合物。

該反應若必要可在鹼存在下進行。

作為該鹼，例如可舉出氫化鈉等鹼金屬氫化物；碳酸鉀等碳酸鹽；第三丁氧化鉀等鹼金屬烷氧化物；及三乙基胺、吡啶、4-(二甲基胺基)吡啶、咪唑等有機鹼類。

對於上述反應，化合物(21)對於化合物(2)1 莫耳而言，一般使用 1~10 莫耳的量，若必要亦可作為溶劑使用。上述鹼的添加若為必要時，對於化合物(2)1 莫耳而言，一般使用 1~10 莫耳的量。

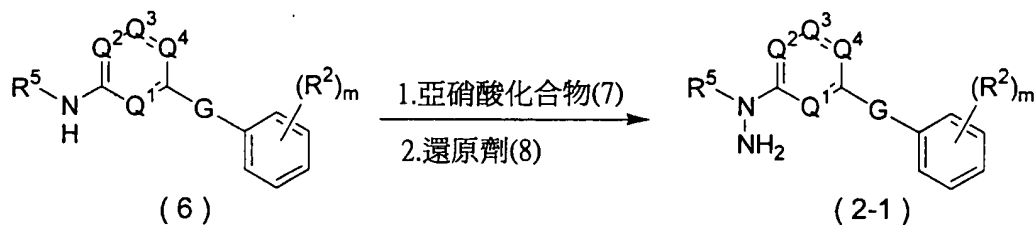
反應溫度一般為 0~100℃的範圍，反應時間一般為 0.5~24 小時的範圍。

反應終了後，反應混合物亦可藉由進行有機溶劑萃取、乾燥、濃縮等後處理操作，分離出化合物(1-4)。經分離的化合物(1-4)可藉由層析、再結晶等做進一步純化。

其次，對於使用於本醯肼化合物的製造之中間體的製造方法做說明。

(參考製造法 1)

化合物(2)中， R^6 為氫原子之化合物(2-1)可藉由反應化合物(6)與亞硝酸化合物(7)後，其次與還原劑(8)進行反應而製造。



[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^5 、G 及 m 表示與前述相同意思]。

該反應可在一般溶劑中進行。

作為使用於反應之溶劑，例如可舉出水、四氫呋喃、二乙基醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚、1,4-二噁烷等醚類、N,N-二甲基甲醯胺等酸醯胺類、甲苯、二甲苯等芳香族烴類、二甲基亞砷等亞砷類、環丁砷；1,2-二氯乙烷、氯仿、氯苯等鹵化烴類及彼等混合物。

作為使用於反應之亞硝酸化合物(7)，例如可舉出亞硝酸鈉等亞硝酸鹽、亞硝酸乙基等亞硝酸酯類。

作為使用於反應之還原劑(8)，例如可舉出亞硫酸鈉等亞硫酸鹽、亞鉛等金屬、氯化錫(II)等。

使用於反應之試劑量，對於式(6)所示化合物 1 莫耳而言，亞硝酸化合物(7)一般為 1~10 莫耳的比率，還原劑(8)一般為 1~10 莫耳的比率。

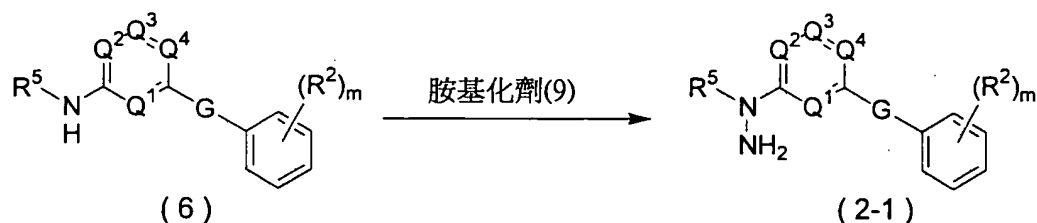
反應該反應的式(6)所示化合物與亞硝酸化合物(7)的步驟中之反應溫度一般為 -20~30℃ 的範圍，反應時間一般為 0.5~24 小時的範圍。

反應化合物(6)與亞硝酸化合物(7)的步驟所得之反應混合物可直接使用於與還原劑(8)進行反應之步驟，該步驟中之反應溫度一般為 -20~50℃ 的範圍，反應時間一般為至 24 小時之範圍。

反應終了，反應混合物可藉由進行有機溶劑萃取、乾燥、濃縮等後處理操作而分離化合物(2-1)。經分離的化合物(2-1)可藉由層析、再結晶等做進一步純化。

(參考製造法 2)

化合物(2)中， R^6 為氫原子之化合物(2-1)亦可由反應化合物(6)與胺基化劑(9)而製造。



[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^5 、 G 及 m 表示與前述相同意思]。

該反應在一般溶劑中進行。

作為反應所使用的溶劑，例如可舉出水、四氫呋喃、二乙基醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚、1,4-二噁烷等醚類、 N,N -二甲基甲醯胺等酸醯胺類、甲苯、二甲苯等芳香族烴類、二甲基亞砜等亞砜類、環丁砜；1,2-二氯乙烷、氯仿、氯苯等鹵化烴類及彼等混合物。

該反應一般在鹼存在下進行。

作為使用於反應之鹼，例如可舉出氫化鈉等鹼金屬氫化物類、碳酸鉀等碳酸鹽類、第三丁氧化鉀等鹼金屬烷氧化物類、氫氧化鈉等金屬氫氧化物及三乙基胺、吡啶等有機胺類。

作為使用於反應之胺基化劑(9)，例如可舉出氯胺等氯胺類、 O -2,4,6-三甲基苯甲羥基胺等 O -醯基羥基胺類、 O -磺醯基羥基胺類、羥基胺- O -磺酸。

上述胺基化劑(9)於該反應中，可在反應系統中產生。

例如作為上述胺基化劑(9)使用氯胺時，亦可將次亞氯酸鈉與氯作為原料使用，將彼等在反應系統中進行混合後產生氯胺。

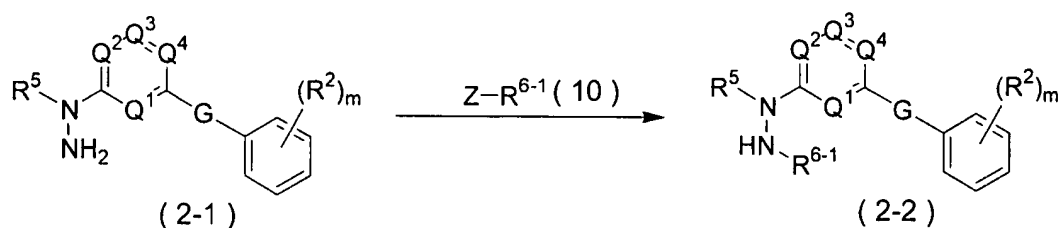
使用於反應之試劑量，對於式(6)所示化合物 1 莫耳而言，胺基化劑(9)一般為 1~10 莫耳之比率，鹼一般為 1~10 莫耳之比率。

該反應之反應溫度一般為 0~100℃的範圍，反應時間一般為 0.5~24 小時的範圍。

反應終了後，反應混合物可藉由進行有機溶劑萃取、乾燥、濃縮等後處理操作而分離化合物(2-1)。經分離的化合物(2-1)可藉由層析、再結晶等進一步純化。

(參考製造法 3)

化合物(2)中， R^6 為 R^{6-1} 之化合物(2-2)亦可藉由反應化合物(2-1)與化合物(10)而製造。



[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^5 、 G 、 Z 及 m 表示與前述相同意思， R^{6-1} 表示可由選自群 E1 的基所取代之 C1-C12 鏈式烴基、可由選自群 E2 的基所取代之苯甲醯基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C3-C12 環烷基或甲醯基]

。

該反應一般可在溶劑中進行。

作為使用於反應之溶劑，例如可舉出四氫呋喃、二乙基醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚、1,4-二噁烷等醚類、N,N-二甲基甲醯胺等酸醯胺類、乙腈等腈類、甲苯、二甲苯等芳香族烴類、乙酸乙酯等酯類、二甲基亞砷等亞砷類、環丁砷；1,2-二氯乙烷、氯仿、氯苯等鹵化烴類及彼等混合物。

該反應一般在鹼存在下進行。

作為使用於反應之鹼，例如可舉出氫化鈉等鹼金屬氫化物類、碳酸鉀等碳酸鹽類、第三丁氧化鉀等鹼金屬烷氧化物類及三乙基胺、吡啶等有機胺類。

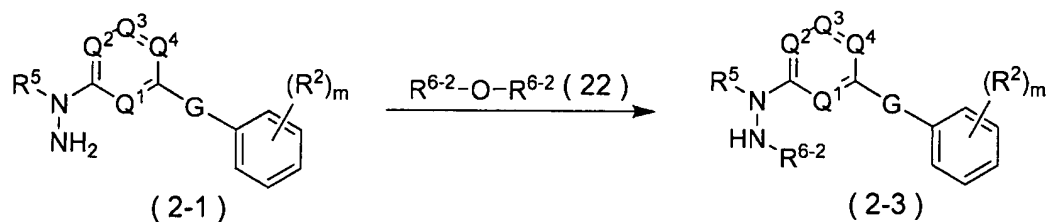
使用於反應之試劑量，對於式(2-1)所示化合物 1 莫耳，化合物(10)一般為 1~10 莫耳的比率，鹼一般為 1~10 莫耳的比率。

該反應的反應溫度一般為 0~100℃的範圍，反應時間一般為 0.5~24 小時的範圍。

反應終了後，反應混合物亦可藉由進行有機溶劑萃取、乾燥、濃縮等後處理操作而分離化合物(2-2)。將分離的化合物(2-2)亦可藉由層析、再結晶等進一步純化。

(參考製造法 4)

化合物(2)中， R^6 為 R^{6-2} 之化合物(2-3)亦可藉由反應化合物(2-1)與化合物(22)而製造。



[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^5 、 G 及 m 表示與前述相同意思， R^{6-2} 表示可由選自群 E2 的基所取代之苯甲醯基、C2-C6 烷基羰基或 C2-C6 烷氧基羰基]。

該反應若必要可使用溶劑進行。

作為該溶劑，例如可舉出四氫呋喃、二乙基醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚、1,4-二噁烷等醚；N,N-二甲基甲醯胺等酸醯胺；乙腈等腈；甲苯、二甲苯等芳香族烴；乙酸乙酯等酯；二甲基亞碲等亞碲；環丁碲；1,2-二氯乙烷、氯仿、氯苯等鹵化烴；及彼等混合物。

該反應若必要可在鹼存在下進行。

作為該鹼，例如可舉出氫化鈉等鹼金屬氫化物；碳酸鉀等碳酸鹽；第三丁氧化鉀等鹼金屬烷氧化物；及三乙基胺、吡啶、4-(二甲基胺基)吡啶、咪唑等有機鹼類。

上述反應中，化合物(22)對於化合物(2-1)1 莫耳，一般使用 1~10 莫耳的量。若必要可將化合物(22)作為溶劑使用。

上述鹼的添加若為必要時，對於化合物(2-1)1 莫耳，一般使用 1~10 莫耳的量。

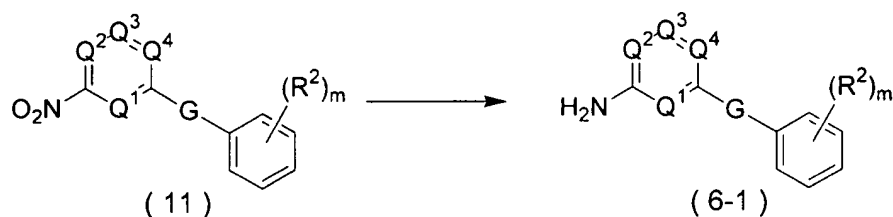
反應溫度一般為 0~100℃ 的範圍，反應時間一般為

0.5 ~ 24 小時的範圍。

反應終了後，反應混合物亦可藉由進行有機溶劑萃取、乾燥、濃縮等後處理操作而分離化合物(2-3)。經分離之化合物(2-3)亦可藉由層析、再結晶等進一步純化。

(參考製造法 5)

化合物(6)中， R^5 為氫原子之化合物(6-1)亦可藉由將化合物(11)以以下(i)~(iii)所示任一方法進行還原而製造。



[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、G 及 m 表示與前述相同意思]。

(i) 過渡金屬觸媒的存在下與氫氣進行反應之方法。

該反應在溶劑中進行。

作為使用於反應之溶劑，例如可舉出乙酸乙酯等酯類、乙醇、甲醇等醇類、水、乙酸、鹽酸及彼等混合物。

作為使用於反應之過渡金屬觸媒，例如可舉出雷尼鎳、鈀-碳及二氧化鉑等。

使用於反應之過渡金屬觸媒的量，對於化合物(11)1 莫耳，一般為 0.01 ~ 0.5 莫耳的比率。

上述氫氣的量對於化合物(11)1 莫耳而言，一般為 1～100 莫耳的比率。

該反應之反應時間一般為 0～80℃的範圍，反應時間一般為 0.1～24 小時的範圍。

反應終了後，將反應混合物過濾，視必要藉由進行有機溶劑萃取、乾燥、濃縮等後處理操作，可分離式(6-1)所示化合物。

經分離的式(6-1)所示化合物亦可藉由層析、再結晶等進一步純化。

(ii)在鹼存在下與聯胺進行反應之方法。

該反應在溶劑中進行。

作為使用於反應之溶劑，例如可舉出二乙二醇、三乙二醇等醚類、水及彼等之混合物。

作為使用於反應的鹼，例如可舉出氫氧化鉀等鹼金屬氫氧化物。

作為使用於反應的聯胺，例如可舉出聯胺水和物。

使用於反應的試劑量，對於化合物(11)1 莫耳而言，鹼一般為 1～10 莫耳的比率，聯胺一般為 1～10 莫耳的比率。

該反應的反應時間一般為 0～100℃的範圍，反應時間一般為 0.5～24 小時的範圍。

反應終了後，將反應混合物藉由進行有機溶劑萃取、乾燥、濃縮等後處理操作，可分離式(6-1)所示化合物。經分離的式(6-1)所示化合物亦可藉由層析、再結晶等進一步

純化。

(iii)在酸的存在下，與金屬進行反應之方法。

該反應一般在溶劑中進行。

作為使用於反應之溶劑，例如可舉出乙醇等醇類、水及彼等之混合物。

作為使用於反應的金屬，例如可舉出鐵、錫及氯化錫(II)。

作為使用於反應的酸，例如可舉出乙酸、鹽酸及硫酸。

使用於反應之試劑量，對於化合物(11)1莫耳而言，金屬一般為2~20莫耳的比率，酸一般為0.1~10莫耳的比率。

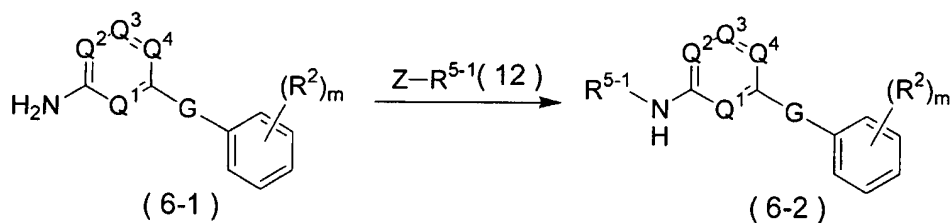
該反應的反應溫度一般為0~100℃的範圍，反應時間一般為0.5~12小時的範圍。

反應終了後，將反應混合物過濾，視必要藉由進行有機溶劑萃取、乾燥、濃縮等後處理操作，可分離式(6-1)所示化合物。

經分離的式(6-1)所示化合物亦可藉由層析、再結晶等進一步純化。

(參考製造法6)

化合物(6)中， R^5 為 R^{5-1} 之化合物(6-2)亦可藉由反應化合物(6-1)與化合物(12)而製造。



[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 G 、 Z 及 m 表示與前述相同意思， R^{5-1} 表示可由選自群E1的基所取代之C1-C12鏈式烴基、可由選自群E2的基所取代之苯甲醯基、C2-C6烷基羰基、C2-C6烷氧基羰基、C3-C12環烷基或甲醯基]該反應一般在溶劑中進行。

作為使用於反應之溶劑，例如可舉出四氫呋喃、二乙基醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚、1,4-二噁烷等醚類；N,N-二甲基甲醯胺等酸醯胺類；乙腈等腈類；甲苯、二甲苯等芳香族烴類；乙酸乙酯等酯類；二甲基亞砷等亞砷類；環丁砷；1,2-二氯乙烷、氯仿、氯苯等鹵化烴類及彼等混合物。

該反應一般在鹼存在下進行。

作為使用於反應之鹼，例如可舉出氫化鈉等鹼金屬氫化物類、碳酸鉀等碳酸鹽類、第三丁氧化鉀等鹼金屬烷氧化物類及三乙基胺、吡啶等有機胺類。

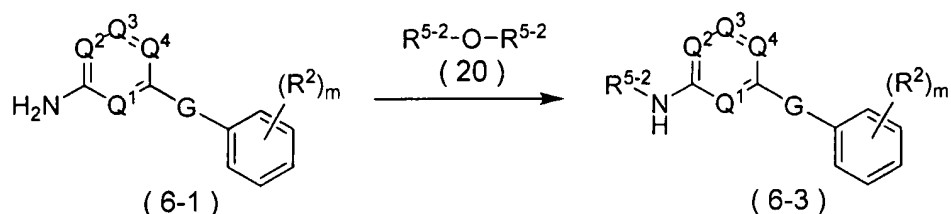
使用於反應之試劑的量，對於化合物(6-1)1莫耳而言，化合物(12)一般為1~10莫耳的比率，鹼一般為1~10莫耳的比率。

該反應的反應溫度一般為0~100℃的範圍，反應時間一般為0.5~24小時的範圍。

反應終了後，將反應混合物藉由進行有機溶劑萃取、乾燥、濃縮等後處理操作，可分離化合物(6-2)。經分離之化合物(6-2)亦可藉由層析、再結晶等進一步純化。

(參考製造法 7)

化合物(6)中， R^5 為 R^{5-2} 之化合物(6-3)可藉由反應化合物(6-1)與化合物(20)而製造。



[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^{5-2} 、G 及 m 表示與前述相同意思]。

該反應若必要可使用溶劑進行。

作為該溶劑，例如可舉出四氫呋喃、二乙基醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚、1,4-二噁烷等醚；N,N-二甲基甲醯胺等酸醯胺；乙腈等腈；甲苯、二甲苯等芳香族烴；乙酸乙酯等酯；二甲基亞砷等亞砷；環丁砜；1,2-二氯乙烷、氯仿、氯苯等鹵化烴；及彼等混合物。

該反應若必要可在鹼存在下進行。

作為該鹼，例如可舉出氫化鈉等鹼金屬氫化物；碳酸鉀等碳酸鹽；第三丁氧化鉀等鹼金屬烷氧化物；及三乙基胺、吡啶、4-(二甲基胺基)吡啶、咪唑等有機鹼類。

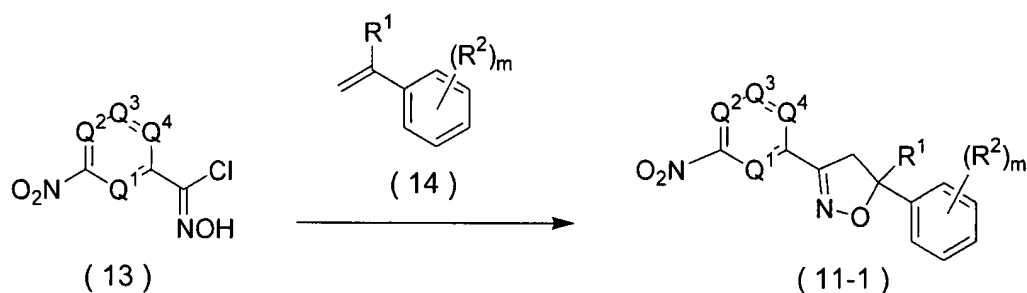
對於上述反應，化合物(20)對於化合物(6-1)1 莫耳而言，一般使用 1~10 莫耳的量，若必要可作為溶劑使用。上述鹼的添加若為必要時，對於化合物(6-1)1 莫耳，一般使用 1~10 莫耳的量。

反應溫度一般為 0~100℃的範圍，反應時間一般為 0.5~24 小時的範圍。

反應終了後，將反應混合物可藉由進行有機溶劑萃取、乾燥、濃縮等後處理操作，分離化合物(6-3)。經分離之化合物(6-3)亦可藉由層析、再結晶等進一步純化。

(參考製造法 8)

化合物(11)中，G 為 G-1 所示基， Y^1 為氧原子之化合物(11-1)可藉由將化合物(13)與鹼進行反應後，其次與化合物(14)進行反應後製造。



[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^1 、 R^2 及 m 表示與前述相同意思]。

該反應一般在溶劑中進行。

作為使用於反應之溶劑，例如可舉出四氫呋喃、二乙

基醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚、1,4-二噁烷等醚類；N,N-二甲基甲醯胺等酸醯胺類；乙腈等腈類；甲苯等烴類；乙酸乙酯等酯類、二甲基亞碲等亞碲類及彼等之混合物。

作為使用於反應的鹼，例如可舉出氫化鈉等鹼金屬氫化物類、碳酸鉀等碳酸鹽類、第三丁氧鉀等鹼金屬烷氧化物類、及三乙基胺、吡啶等有機胺類。

使用於反應的試劑之量對於化合物(13)1莫耳而言，化合物(14)一般為1~10莫耳的比率，鹼一般為1~10莫耳的比率。

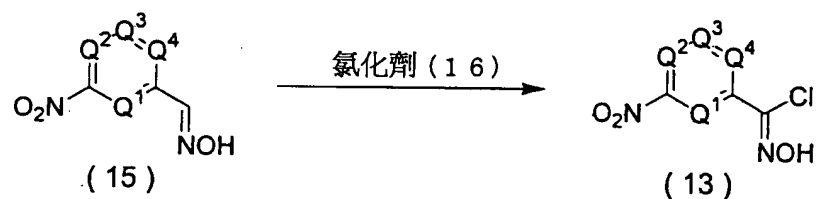
該反應的化合物(13)與鹼之反應步驟中的反應溫度一般為0~80℃的範圍，反應時間一般為0.5~24小時的範圍。

化合物(13)與鹼之反應步驟所得之反應混合物可直接使用於與化合物(14)的反應步驟，該步驟中之反應溫度一般為0~80℃的範圍，反應時間一般為0.5~24小時的範圍。

反應終了後，將反應混合物藉由進行有機溶劑萃取、乾燥、濃縮等後處理操作，可分離化合物(11-1)。經分離之化合物(11-1)亦可藉由層析、再結晶等進一步純化。

(參考製造法 9)

化合物(13)可藉由將化合物(15)與氯化劑(16)進行反應而製造。



[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 表示與前述相同意思]。

該反應一般在溶劑中進行。

作為使用於反應之溶劑，例如可舉出四氫呋喃、二乙基醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚、1,4-二噁烷等醚類；甲苯等烴類；乙酸乙酯等酯類；N,N-二甲基甲醯胺等酸醯胺類；乙腈等腈類；二甲基亞砷等亞砷類及彼等之混合物。

作為使用於反應的氯化劑(16)，例如可舉出氯氣及 N-氯琥珀醯亞胺。

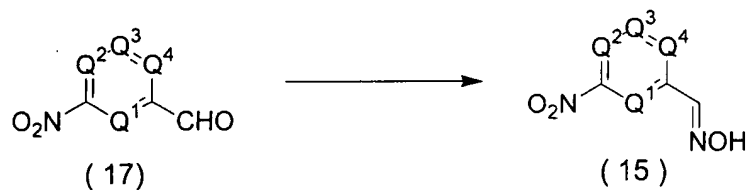
使用於反應的試劑量，對於化合物(15)1 莫耳而言，氯化劑(16)一般為 1~10 莫耳的比率。

該反應之反應溫度一般為 $-20 \sim 80^\circ\text{C}$ 的範圍。反應時間一般為 0.5~24 小時的範圍。

反應終了後，將反應混合物藉由進行有機溶劑萃取、乾燥、濃縮等後處理操作，可分離化合物(13)。經分離之化合物(13)亦可藉由層析、再結晶等進一步純化。

(參考製造法 10)

化合物(15)可藉由反應化合物(17)與羥基胺而製造。



[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 表示與前述相同意思]。

該反應一般在溶劑中進行。

作為使用於反應之溶劑，例如可舉出四氫呋喃、二乙基醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚、1,4-二噁烷等醚類；甲苯等烴類；乙酸乙酯等酯類；N,N-二甲基甲醯胺等酸醯胺類；乙醇、甲醇等醇類；乙腈等腈類；二甲基亞砷等亞砷類；水及彼等之混合物。

作為使用於該反應的羥基胺，可舉出羥基胺鹽酸鹽及羥基胺硫酸鹽等羥基胺與無機酸之鹽的形態下在反應系統內生成羥基胺者，此情況下，該反應在鹼之存在下進行。作為此情況所使用的鹼，例如可舉出三乙基胺等有機胺類、碳酸鈉等碳酸鹽類及氫氧化鈉等鹼金屬氫氧化物類。

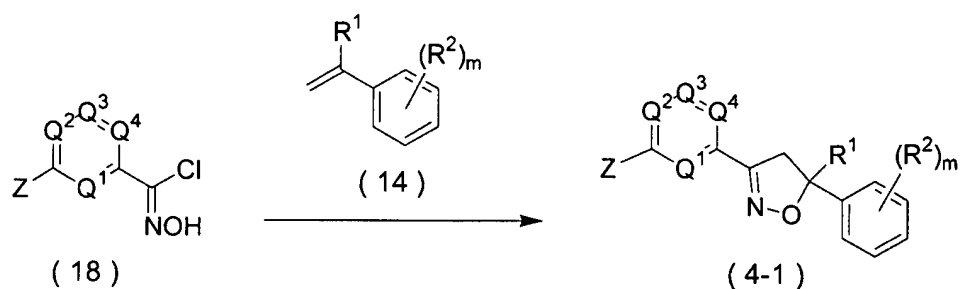
使用於反應之試劑量，對於化合物(17)1莫耳而言，羥基胺一般為1~10莫耳的比率，使用羥基胺與無機酸的鹽時所使用的鹼之量，對於羥基胺與無機酸之鹽1莫耳而言，一般為1~10莫耳的比率。

該反應之反應溫度一般為0~80℃之範圍，反應時間一般為0.5~24小時的範圍。

反應終了後，將反應混合物藉由進行有機溶劑萃取、乾燥、濃縮等後處理操作，可分離化合物(15)。經分離之化合物(15)亦可藉由層析、再結晶等進一步純化。

(參考製造法 11)

化合物(4)中，G 為 G-1 所示基，Y¹ 為氧原子之化合物(4-1)可藉由將化合物(18)與鹼進行反應後，其次與化合物(14)進行反應而製造。



[式中，Q¹、Q²、Q³、Q⁴、R¹、R²、Z 及 m 表示與前述相同意思]。

該反應一般在溶劑中進行。

作為使用於反應之溶劑，例如可舉出四氫呋喃、二乙基醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚、1,4-二噁烷等醚類；N,N-二甲基甲醯胺等酸醯胺類；乙腈等腈類、甲苯等烴類；乙酸乙酯等酯類；二甲基亞碲等亞碲類及彼等之混合物。

作為使用於反應的鹼，例如可舉出氫化鈉等鹼金屬氫化物類、碳酸鉀等碳酸鹽類、第三丁氧鉀等鹼金屬烷氧化物類、及三乙基胺、吡啶等有機胺類。

使用於反應的試劑之量，對於化合物(18)1 莫耳，化合物(14)一般為 1~10 莫耳的比率，鹼一般為 1~10 莫耳

的比率。

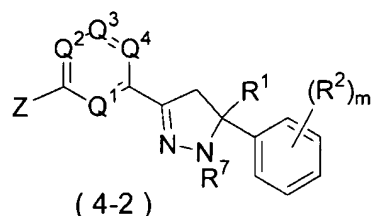
反應該反應的化合物(18)與鹼之步驟中的反應溫度一般為 $0 \sim 80^{\circ}\text{C}$ 的範圍，反應時間一般為 $0.5 \sim 24$ 小時的範圍。

在反應化合物(18)與鹼之步驟所得的反應混合物，可直接使用於與化合物(14)之反應步驟，該步驟中之反應溫度一般為 $0 \sim 80^{\circ}\text{C}$ 的範圍，反應時間一般為 $0.5 \sim 24$ 小時的範圍。

反應終了後，將反應混合物藉由進行有機溶劑萃取、乾燥、濃縮等後處理操作，分離化合物(4-1)。經分離之化合物(4-1)亦可藉由層析、再結晶等進一步純化。

(參考製造法 12)

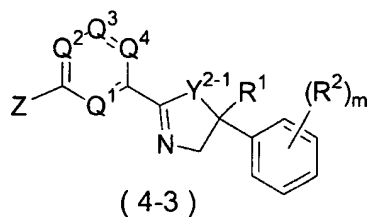
化合物(4)中，G 為 G-1 所示基， Y^1 為 NR^7 基的式(4-2)所示化合物，例如可依據國際專利申請 WO2007/123855 手冊所記載的方法而製造。



[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^1 、 R^2 、 R^7 、Z 及 m 表示與前述相同意思]。

(參考製造法 13)

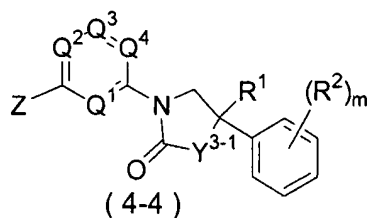
化合物(4)中，G 為 G-2 所示基， Y^2 為 Y^{2-1} 之式(4-3)所示化合物，例如可依據特開 2007-91708 號公報所記載的方法而製造。



[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^1 、 R^2 、Z 及 m 表示與前述相同意思， Y^{2-1} 表示氧原子、硫原子、伸甲基]。

(參考製造法 14)

化合物(4)中，G 為 G-3 所示基， Y^3 為 Y^{3-1} 之式(4-4)所示化合物，例如可依據國際專利申請 WO2007/123853 手冊所記載的方法而製造。

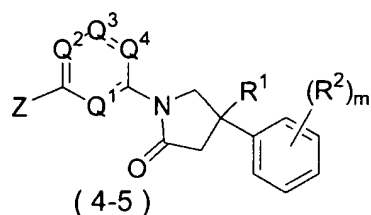


[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^1 、 R^2 、Z 及 m 表示與前述相同意思， Y^{3-1} 表示氧原子、 NR^7 ， R^7 表示與前述相同意思]

。

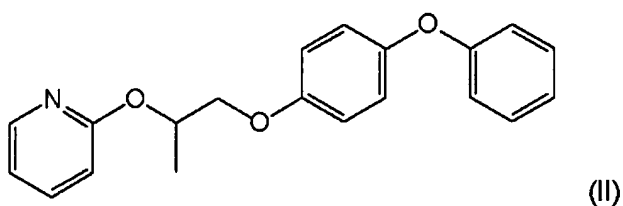
(參考製造法 15)

化合物(4)中，G 為 G-3 所示基， Y^3 為伸甲基之式(4-5)所示化合物，例如可依據特開 2008-110971 號公報所記載的方法而製造。



[式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^1 、 R^2 、Z 及 m 表示與前述相同意思]。

百利普芬(pyriproxyfen；4-苯氧基苯基=2-(吡啶氧基)丙基=醚)為下述式(II)所示化合物，其為特開昭 60-215671 號公報所記載之化合物。



百利普芬，例如可依據特開昭 60-215671 號公報等所記載的方法而製造。又，亦可使用販賣的農藥製劑所使用的化合物。

作為本發明的防除有害生物之組成物可顯示效力的有

害生物，例如可舉出有害昆蟲類或有害蜚蠊類等有害節足動物。更具體可舉出下述者。

半翅目害蟲：斑飛蝨(*Laodelphax striatellus*)、褐飛蝨(*Nilaparvata lugens*)、白背飛蝨(*Sogatella furcifera*)等飛蝨類、偽黑尾葉蟬(*Nephotettix cincticeps*)、台灣偽黑尾葉蟬(*Nephotettix virescens*)、*Empoasca onukii* 等浮塵子類、棉蚜(*Aphis gossypii*)、桃蚜(*Myzus persicae*)、甘藍蚜(*Brevicoryne brassicae*)、捲葉蚜(*Aphis spiraeicola*)、馬鈴薯網管蚜(*Macrosiphum euphorbiae*)、馬鈴薯蚜(*Aulacorthum solani*)、稻麥蚜(*Rhopalosiphum padi*)、大橘蚜(*Toxoptera citricidus*)、桃粉大尾蚜(*Hyalopterus pruni*)等蚜蟲類、草綠椿象(*Nezara antennata*)、點蜂緣椿象(*Riptortus clavatus*)、中華稻緣椿(*Leptocorisa chinensis*)、*Eysarcoris parvus*、茶翅椿象(*Halyomorpha mista*)等椿象類、橫帶錐獵椿(*Triatoma rubrofasciata*)等獵椿類、溫室粉蝨(*Trialeurodes vaporariorum*)、煙草粉蝨(*Bemisia tabaci*)、柑桔雙孔粉蝨(*Dialeurodes citri*)、柑橘刺粉蝨(*Aleurocanthus spiniferus*)等粉蝨類、柑橘刺粉蝨(*Aonidiella aurantii*)、梨圓介殼蟲(*Comstockaspis perniciosus*)、桔矢尖介殼蟲(*Unaspis citri*)、紅蠟蚧(*Ceroplastes rubens*)、吹綿介殼蟲(*Icerya purchasi*)、臀紋粉介殼蟲(*Planococcus kraunhiae*)、柑桔粉介殼蟲(*Planococcus citri*)、*Pseudococcus longispinis*、桑介殼蟲(*Pseudaulacaspis pentagona*)等介殼蟲類、網蝽類、溫帶溴蟲(*Cimex lectularius*)、熱帶溴蟲(*Cimex hemipterus*)

等 溴 蟲 類、黃木蝨(*Cacopsylla pyricola*)等木蝨類等。

鱗翅目害蟲：二化螟蟲(*Chilo suppressalis*)、三化螟蟲(*Tryporyza incertulas*)、稻縱捲葉野螟蛾(*Cnaphalocrocis medinalis*)、棉捲葉野螟(*Notarcha derogata*)、印度穀蛾(*Plodia interpunctella*)、亞洲玉米螟(*Ostrinia furnacalis*)、菜心野螟蛾(*Hellula undalis*)、*Pediasia teterrellus* 等螟蛾類、斜紋夜蛾(*Spodoptera litura*)、甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua*)、黏夜蛾(*Pseudaletia separata*)、圓白菜飛蛾(*Mamestra brassicae*)、球菜夜蛾(*Agrotis ipsilon*)、黑點銀紋夜蛾(*Autographa nigrisigna*)、*trichoplusia* 屬、*Heliothis* 屬、*Helicoverpa* 屬等夜蛾類、白粉蝶(*Pieris rapae*)等白蝶類、*Adoxophyes* 屬、桃折心蟲(*Grapholita molesta*)、大豆食心蟲(*Leguminivora glycinivorella*)、*Matsumuraeses azukivora*、*Adoxophyes orana fasciata*、捲葉蛾(*Adoxophyes honmai.*)、茶捲葉蛾(*Homona magnanima*)、茶姬捲葉蛾(*Archips fuscocupreanus*)、蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella*)等捲蛾類、茶細蛾(*Caloptilia theivora*)、金紋細蛾(*Phyllonorycter ringoneella*)等細蛾類、桃蛀果蛾(*Carposina niponensis*)等蛀果蛾類、蕃茄蛾(*Tuta absoluta*)、*Lyonetia* 屬等潛葉蛾類、毒蛾屬、黃毒蛾屬等毒蛾類、小菜蛾(*Plutella xylostella*)等小蛾類、棉紅鈴蟲(*Pectinophora gossypiella*)、馬鈴薯蛾(*Phthorimaea operculella*)等旋蛾類、美國白蛾(*Hyphantria cunea*)等白蛾類、衣蛾(*Tinea translucens*)、小衣蛾(*Tineola bisselliella*)等蕈蛾類等。

薊馬目害蟲：橘黃薊馬(*Frankliniella occidentalis*)、南黃薊馬(*Thrips parvi*)、茶黃薊馬(*Scirtothrips dorsalis*)、蔥薊馬(*Thrips tabaci*)、台灣花薊馬(*Frankliniella intonsa*)等薊馬類等。

雙翅目害蟲：淡色庫蚊(*Culex pipiens pallens*)、三班家蚊(*Culex tritaeniorhynchus*)、熱帶家蚊(*Culex quinquefasciatus*)等家蚊類、埃及斑蚊(*Aedes aegypti*)、白線斑蚊(*Aedes albopictus*)等斑蚊屬、中華按蚊(*Anopheles sinensis*)、*Anopheles gambiae*、微小按蚊(*Anopheles minimus*)、史帝芬塞瘧蚊(*Anopheles stephensi*)、*Anopheles albimanus*等瘧蚊屬、搖蚊類、家蚊(*Musca domestica*)、大家蚊(*Muscina stabulans*)等家蚊類、麗蠅類、肉蠅類、廁蠅類、采采蠅(*Glossina palpalis*)等虱蠅類、種蠅(*Delia platura*)、洋蔥蠅(*Delia antiqua*)等花蠅類、稻潛(葉)蠅(*Agromyza oryzae*)、水稻潛葉蠅(*Hydrellia griseola*)、蕃茄潛葉蠅(*Liriomyza sativae*)、豆子潛葉蠅(*Liriomyza trifolii*)、韭潛蠅(*Chromatomyia horticola*)等潛蠅類、水稻稈蠅(*Chlorops oryzae*)等稈蠅類、對瓜實蠅(*Dacus cucurbitae*)、地中海果實蠅(*Ceratitis capitata*)等實蠅類、猩猩蠅類、東亞異蚤蠅(*Megaselia spiracularis*)等蚤蠅類、白斑蛾蚋(*Clogmia albipunctata*)、鱗喙白蛉(*Phlebotomus squamirostris*)、沙蠅(*Lutzomyia longipalpis*)等蝶蠅類、蚋類、牛虻(*Tabanus trigonus*)等虻類、刺蠅類等。

鞘翅目害蟲：西部玉米根蟲(*Diabrotica virgifera virgifera*)、西部黃瓜甲蟲(*Diabrotica undecimpunctata howardi*)等

玉米根蟲類、金龜子(*Anomala cuprea*)、姬金龜(*Anomala rufocuprea*)、日本豆金龜(*Popillia japonica*)等金龜類、玉米象(*Sitophilus zeamais*)、溫室粉蝨(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、綠豆象(*Callosobruchus chienensis*)、稻根象甲(*Echinocnemus squameus*)、棉鈴象鼻蟲(*Anthonomus grandis*)、*Sphenophorus venatus*、捲葉象鼻蟲(*Rhynchophorus ferrugineus*)等象鼻蟲類、黃粉蟲(*Tenebrio molitor*)、赤擬穀盜(*Tribolium castaneum*)等瓢蟲類、稻負泥蟲(*Oulema oryzae*)、黃守瓜(*Aulacophora femoralis*)、黃條葉蚤(*Phyllotreta striolata*)、科羅拉多金花蟲(*Leptinotarsa decemlineata*)等金花蟲類、鯽節蟲(*Anthrenus verbasci*)、白腹皮蠹(*Dermestes maculatus*)等鯽節蟲類、煙甲蟲(*Lasioderma serricorne*)等甲蟲類、茄二十八星瓢蟲(*Epilachna vigintioctopunctata*)等瓜黑斑瓢蟲類、褐粉蠹(*Lyctus brunneus*)、松樹甲蟲(*Tomicus piniperda*)等小蠹蟲類、硬穀蟲類、蛛蠹類、星天牛(*Anoplophora malasiaca*)等天牛類、細胸金針蟲類(*Agriotes spp.*)蟻型隱翅蟲(*Paederus fuscipes*)等。

直翅目害蟲：飛蝗(*Locusta migratoria*)、非洲螞蚱(*Gryllotalpa africana*)、小翅稻蝗(*Oxya yezoensis*)、長翅稻蝗(*Oxya japonica*)、蟋蟀類等。

隱翅目害蟲：人蚤(*Pulex irritans*)、貓蚤(*Ctenocephalides felis*)、狗蚤(*Ctenocephalides canis*)、東方鼠蚤(*Xenopsylla cheopis*)、穿皮潛蚤(*Tunga penetrans*)、雞蚤(*Echidnophaga gallinacea*)、歐洲鼠蚤(*Nosopsyllus fasciatus*)等。

蝨目害蟲：體蝨(*Pediculus humanus corporis*)、頭蝨(*Pediculus humanus humanus*)、陰蝨(*Phthirus pubis*)、牛蝨(*Haematopinus eurysternus*)、羊蝨(*Dalmalinia ovis*)、豬蝨(*Haematopinus suis*)等。

膜翅目害蟲：小黃家蟻(*Monomorium pharaonis*)、日本山蟻(*Formica fusca japonica*)、光滑管琉璃蟻(*Ochetellus glaber*)、雙針蟻(*Pristomyrmex pungens*)、寬結大頭蟻(*Pheidole noda*)、切葉蟻(*Acromyrmex* spp.)、火家蟻(*Solenopsis* spp.)、阿根廷蟻(*Linepithema humile*)等蟻類、雀蜂類、蟻形蜂類、蕪菁葉蜂(*Athalia rosae*)、日本葉蜂(*Athalia japonica*)等葉蜂類等。

蟑螂目害蟲：德國蟑螂(*Blattella germanica*)、煙褐蟑螂(*Periplaneta fuliginosa*)、美洲蟑螂(*Periplaneta americana*)、棕色蟑螂(*Periplaneta brunnea*)、小蟑螂(*Blatta orientalis*)等蟑螂類、大和白蟻(*Reticulitermes speratus*)、家白蟻(*Coptotermes formosanus*)、小楹白蟻(*Incisitermes minor*)、截頭堆砂白蟻(*Cryptotermes domesticus*)、台灣白蟻(*Odontotermes formosanus*)、恆春新白蟻(*Neotermes koshunensis*)、赤樹白蟻(*Glyptotermes satsumensis*)、中島白蟻(*Glyptotermes nakajimai*)、黑樹白蟻(*Glyptotermes fuscus*)、小玉白蟻(*Glyptotermes kodamai*)、串本白蟻(*Glyptotermes kushimensis*)、大城蟑螂(*Hodotermopsis japonica*)、*Coptotermes guangzhoensis*、*Reticulitermes miyatakei*、*Reticulitermes flaviceps amamianus*、鼻白蟻(*Reticulitermes* sp.)、高砂白蟻

(*Nasutitermes takasagoensis*)、近扭白蟻(*Pericapritermes nitobei*)、台華歪白蟻(*Sinocapritermes mushae*)等白蟻類等。

蜱蟎目害蟲：二點葉蟎(*Tetranychus urticae*)、澤氏葉蟎(*Tetranychus kanzawai*)、柑橘葉蟎(*Panonychus citri*)、蘋果葉蟎(*Panonychus ulmi*)、葉蟎屬等蟎類、桔刺皮節蜱(*Aculops pelekassi*)、琉球桔刺皮節蜱(*Phyllocoptruta citri*)、蕃茄蜱(*Aculops lycopersici*)、紫節蜱(*Calacarus carinatus*)、茶尖葉節蜱(*Acaphylla theavagrans*)、*Eriophyes chibaensis*、蘋果葉節蜱(*Aculus schlechtendali*)等節蜱類、茶細蟎(*Polyphagotarsonemus latus*)、氣管蟎(*Acarapis woodi*)等塵蟎類、紫偽葉蟎(*Brevipalpus phoenicis*)等姬蟎類、長毛蟎類、美洲鈍眼蜱(*Amblyomma americanum*)、斑點鈍眼蜱(*Amblyomma maculatum*)、牛蜱(*Boophilus microplus*)、牛壁蝨(*Boophilus annulatus*)、美國犬壁蝨(*Dermacentor variabilis*)、台灣革蜱(*Dermacentor taiwanicus*)、安氏革蜱(*Dermacentor andersoni*)、長角血蜱(*Haemaphysalis longicornis*)、大和血蜱(*Haemaphysalis flava*)、鈴頭血蜱(*Haemaphysalis campanulata*)、卵形硬蜱(*Ixodes ovatus*)、全溝硬蜱(*Ixodes persulcatus*)、腓硬蜱(*Ixodes scapularis*)、大西洋硬蜱(*Ixodes pacificus*)、澳大利亞麻痺壁蝨(*Ixodes holocyclus*)、棕色犬壁蝨(*Rhipicephalus sanguineus*)、尾扇頭蜱(*Rhipicephalus appendiculatus*)等扁蝨類、波斯銳緣蜱(*Argas persicus*)等軟蜱類、犬貓耳癢蟎(*Octodectes cynotis*)等耳癢蟎類、疥蟲屬疥瘡(*Sarcoptes*

scabiei)等疥蟲屬疥瘡類、皮膚疥蟲(*Listrophorus gibbus*)等疥蟲類、犬疥癬蟲(*Demodex canis*)等疥癬蟲類、腐食酪蟎(*Tyrophagus putrescentiae*)、腐食酪蟎(*Tyrophagus similis*)等粉蟎類、美洲塵蟎(*Dermatophagoides farinae*)、塵蟎(*Dermatophagoides ptrehyssnus*)等塵蟎類、普通肉食蟎(*Cheyletus eruditus*)、馬六甲肉食蟎(*Cheyletus malaccensis*)、南肉食蟎(*Cheyletus moorei*)等肉食蟎類、柏氏禽刺蟎(*Ornithonyssus bacoti*)、鳥刺蟎(*Ornithonyssus sylvaairum*)、蜂蟹蟎(*Varroa jacobsoni*)等刺蟎類、家禽蝨子(*Dermanyssus gallinae*)等家禽蝨子類、紅纖恙蟎(*Leptotrombidium akamushi*)等纖恙蟎類等、日本紅螯蛛(*Chiracanthium japonicum*)、紅色蜘蛛(*Latrodectus hasseltii*)等蜘蛛類等。

唇腳綱類：*Thereuonema hilgendorfi*、少棘真蜈蚣(*Scolopendra subspinipes*)等。

倍腳綱類：高雅酸帶馬陸(*Oxidus gracilis*)、*Nedyopus tambanus*等。

等腳目類：球鼠婦(*Armadillidium vulgare*)等。

腹足綱類：*Limax marginatus*、黃蛞蝓(*Limax flavus*)等。

本發明的防除有害生物之組成物雖可僅含有本醯肼化合物及百利普芬，一般為混合固體載體、液體載體及/或氣狀載體，進一步視必要可添加界面活性劑等其他製劑用補助劑，可製劑化為乳化劑、油劑、油性液劑、水性液劑、溶解液、洗劑、懸浮劑等液劑、粉劑、粒劑、漿狀製劑

、乳霜劑、軟膏劑、微膠囊化製劑、泡沫劑、氣膠製劑、碳酸氣製劑、錠劑、咀嚼錠、丸劑、膠囊劑、動物用飼料預混合、糖漿劑、薄片製劑、薄膜狀製劑、樹脂製劑、注射劑、埋入劑、塞劑等形態。這些製劑可加工成毒餌、蚊香、電氣蚊香片、燻煙劑、燻蒸劑、薄片而使用。

這些製劑的含有量為本醯肼化合物及百利普芬的合計量下一般為 0.1～95 重量%。

作為製劑化時所使用的固體載體，例如可舉出黏土類(高嶺黏土、矽藻土、膨潤土、氟素磷灰石、酸性白土等)、合成含氫氧化矽、滑石、陶瓷、其他無機礦物(絹雲母、石英、硫、活性碳、碳酸鈣、水合二氧化矽等)、化學肥料(硫安、磷安、硝安、鹽安、尿素等)等微粉末及粒狀物。

作為液體載體，例如可舉出芳香族或脂肪族烴類(二甲苯、甲苯、烷基萘、苯基二甲苯基乙烷、煤油、輕油、己烷、環己烷等)、鹵化烴類(氯苯、二氯甲烷、二氯乙烷、三氯乙烷等)、醇類(甲醇、乙醇、異丙基醇、丁醇、己醇、乙二醇等)、醚類(二乙基醚、乙二醇二甲基醚、二乙二醇單甲基醚、二乙二醇單乙基醚、丙二醇單甲基醚、四氫呋喃、二噁烷等)、酯類(乙酸乙酯、乙酸丁酯等)、脂肪酸酯類(己二酸二異丙酯、己二酸二異丁酯、肉豆蔻酸異丙酯等)、酮類(丙酮、甲基乙酮、甲基異丁酮、環己酮等)、腈類(乙腈、異丁腈等)、亞砒類(二甲基亞砒等)、酸醯胺類(N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺等)、吡咯烷

酮類(N-甲基-2-吡咯烷酮、N-辛基-2-吡咯烷酮等)、碳酸丙烯酯、乳酸乙酯、1,3-二甲基-2-咪唑二酮、植物油(大豆油、綿實油等)、植物精油(橙油、牛膝草油、檸檬油等)矽油(二甲基矽油、高聚合二甲基矽油、環狀矽油、聚醚改性矽油、胺基改性矽油、甲基苯基矽油等)及水等。

作為氣體狀載體，例如可舉出丁烷氣、氟氯烴氣體、液化石油氣體(LPG)、二甲基醚、碳酸氣等。

作為界面活性劑，例如可舉出烷基硫酸酯鹽、烷基磺酸鹽、烷基芳基磺酸鹽、烷基芳基醚類及其聚環氧乙烷化物、聚乙二醇醚類、多元醇酯類及糖醇衍生物。

作為其他製劑用補助劑，可舉出固著劑、分散劑及安定劑等，具體例如可舉出酪蛋白、明膠、多糖類(澱粉、阿拉伯橡膠、纖維素衍生物、褐藻酸等)、木質素衍生物、膨潤土、糖類、合成水溶性高分子(聚乙烯基醇、聚乙烯基吡咯烷酮、聚丙烯酸類等)、PAP(酸性磷酸異丙基)、BHT(2,6-二-第三丁基-4-甲基酚)、BHA(2-第三丁基-4-甲氧基酚與3-第三丁基-4-甲氧基酚之混合物)、植物油、礦物油、脂肪酸及脂肪酸酯。

作為樹脂製劑的基材，例如可舉出鹽化乙烯基系聚合體、聚尿烷等，這些基材視必要可添加苯二酸酯類(苯二酸二甲基、苯二酸二辛基等)、己二酸酯類、硬脂酸等可塑劑。樹脂製劑為於該基材中將化合物使用一般混煉裝置進行混煉後，藉由射出成型、押出成型、加壓成型等進行成型而得，視必要可進一步經由成型、裁斷等步驟，加工

成板狀、薄膜狀、帶狀、網狀、條狀等樹脂製劑。這些樹脂製劑，例如可加工成動物用項圈、動物用耳標、薄片製劑、牽帶、園藝用支柱。

作為毒餌的基材，例如可舉出穀物粉、植物油、糖、結晶纖維素等，視必要進一步可添加二丁基羥基甲苯、去甲二氫愈創木酸等抗氧化劑、脫氫乙酸等保存料、辣椒末等兒童或寵物的誤食防止劑、乳酪香料、洋蔥香料、花生油等害蟲誘引性香料等。

本發明的有害生物防除方法係將本醯肼化合物與百利普芬的有效量直接施用於有害生物、及/或施用於有害生物的生息場所(植物體、動物體、家屋內、土壤等)而進行。本醯肼化合物及百利普芬可同時期各施用，一般由施用時的簡便性觀點來看，作為本發明的防除有害生物之組成物施用。

將本醯肼化合物與百利普芬使用於農林害蟲的防除時，該施用量在本醯肼化合物及百利普芬的合計量下一般為 $1 \sim 10000 \text{ g/ha}$ ，較佳為 $10 \sim 500 \text{ g/ha}$ 。乳劑、水合劑、可流動劑、微膠囊製劑等係以水等一般稀釋至本醯肼化合物及百利普芬的合計的 $1 \sim 1000 \text{ ppm}$ 後使用，粉劑、粒劑等一般可直接使用。對於使用這些製劑來防除有害生物而受到保護的植物則可直接散布。將這些製劑藉由於土壤進行處理，亦可防除棲息於土壤的有害生物，又，這些製劑可在種植植物前的苗床進行處理，或亦可在種植時對種植孔或出芽處進行處理。

且，將本發明的有害生物防除劑之薄片製劑捲入植物中，或設置於植物附近，或覆蓋於出芽處的土壤表面等方法亦可施用。

本發明的有害生物防除劑，可使用在栽培下述「作物」的農地上。

農作物；玉米、水稻、小麥、大麥、裸麥、燕麥、粱、棉花、大豆、花生、蕎麥、甜菜、菜子、向日葵、甘蔗、煙草等、蔬菜；茄科蔬菜(茄子、蕃茄、青椒、辣椒、馬鈴薯等)、瓜科蔬菜(小黃瓜、南瓜、西葫蘆、西瓜、哈密瓜等)、油菜科蔬菜(白蘿蔔、蕪、西洋山葵、蕪菁、白菜、包心菜、芥子菜、花椰菜、花菜等)、菊科蔬菜(牛蒡、春菊、茼蒿、萵苣等)、百合科蔬菜(蔥、洋蔥、蒜頭、蘆筍)、傘形科蔬菜(紅蘿蔔、西洋芹菜、芹菜、歐防风等)、藜科蔬菜(菠菜、莧菜等)、紫蘇科蔬菜(紫蘇、薄荷、羅勒等)、草莓、蕃薯、山芋、芋頭等、花卉、觀葉植物、果樹；仁果類(蘋果、西洋梨、日本梨、木瓜、榲桲等)、核果類(水蜜桃、桃子、油桃、梅子、櫻桃、杏子、歐洲李等)、柑橘類(溫州蜜柑、柳橙、檸檬、萊姆、葡萄柚等)、堅果類(栗子、核桃、榛、杏仁果、銀杏果、腰果、澳洲胡桃等)、液果類(藍莓、蔓越莓、黑莓、覆盆子等)、葡萄、柿子、橄欖、柿枇杷、香蕉、咖啡、棗椰子、椰子等、果樹以外的樹；茶、桑、花木、街路樹(日本櫟、樺木、花水木、桉樹、銀杏、紫丁香花、楓、檉、楊柳、紫荊、楓香、懸鈴木、檉樹、黑檜、日本冷杉、鐵杉、杜松

、松、唐檜、東北紅豆杉)等。

「作物」中亦包含基因重組作物。

將本醯肼化合物與百利普芬作為防疫用使用時，該施用量適用於空間時，本醯肼化合物及百利普芬的合計下一般為 $0.001 \sim 10 \text{ mg/m}^3$ ，適用於平面時為 $0.001 \sim 100 \text{ mg/m}^2$ 。乳劑、水合劑、可流動劑等一般為以水稀釋至本醯肼化合物及百利普芬合計的濃度下為 $0.01 \sim 10000 \text{ ppm}$ 後施用，亦可直接施用油劑、氣膠、燻煙劑、毒餌等。

將本醯肼化合物與百利普芬使用於牛、馬、豬、綿羊、羊、雞等家畜、狗、貓、大鼠、老鼠等小動物的外部寄生蟲防除時，對於獸醫學上公知的經口的或非經口投與方法，可使用於動物。作為具體的使用方法，在以全身抑制為目的的情況時，例如可舉出錠劑(含有丸劑、糖衣錠、薄膜塗佈錠)、咀嚼錠、膠囊劑、粒劑(顆粒劑、細粒劑、散劑等)、液劑(乳劑、懸浮劑等)、薄膜狀製劑等經口劑；及注射劑(例如皮下注射劑、靜脈內注射劑、肌肉內注射劑、腹腔內注射劑、點滴劑、緩釋性注射劑)、塞劑(例如直腸塞劑、陰塞劑)、埋入劑(含有埋入錠、將活體內分解性聚合物作為基材所成形者、封入於鈦等活體適合性金屬膠囊，以一定速度釋出有效成分者)等非經口劑等。且，在經口投與時，可將上述製劑混入於飼料後使用。

又，將非全身的抑制作為目的時，例如噴霧油劑或水性液劑、塗佈乳霜劑、軟膏劑等外用劑、將液劑進行 POUR-ON 處理或進行 SPOT-ON 處理、以洗劑製劑洗淨動物或將

樹脂製劑作為首輪或耳標附加於動物等方法而使用。投與於動物體時的本醯肼化合物及百利普芬的合計量一般對於動物體重 1kg 而言為 0.1～1000mg 的範圍。

上述獸醫學上的投與方法所使用的製劑形中，作為製劑素材使用慣用的各種有機或無機載體物質，添加固形製劑之賦形劑、滑澤劑、結合劑、崩壞劑；液狀製劑之溶劑、溶解補助劑、懸浮化劑、等張化劑、緩衝劑、無痛化劑等。又視必要，可使用防腐劑、抗氧化劑、著色劑、甘味劑等製劑添加物。作為賦形劑的較佳例子，可舉出乳糖、白糖、D-甘露醇、D-山梨糖醇、澱粉、 α 化澱粉、糊精、結晶纖維素、低取代度羥基丙基纖維素、羧基甲基纖維素鈉、阿拉伯橡膠、糊精、聚三葡萄糖、輕質無水矽酸、合成矽酸鋁、鎂鋁矽酸鹽等。作為滑澤劑的較佳例子，可舉出硬脂酸鎂、硬脂酸鈣、滑石、矽溶膠等。作為結合劑的較佳例，可舉出 α 化澱粉、蔗糖、明膠、阿拉伯橡膠、甲基纖維素、羧基甲基纖維素、羧基甲基纖維素鈉、結晶纖維素、白糖、D-甘露醇、海藻糖、糊精、聚三葡萄糖、羥基丙基纖維素、羥基丙基甲基纖維素、聚乙烯基吡咯烷酮等。作為崩壞劑的較佳例子，可舉出乳糖、白糖、澱粉、羧基甲基纖維素、羧基甲基纖維素鈣、交聯羧基甲基纖維素鈉、羧基甲基澱粉鈉、輕質無水矽酸、低取代度羥基丙基纖維素等。作為溶劑的較佳例子，可舉出注射用水、生理的食鹽水、林格氏液、醇、丙二醇、聚乙二醇、芝麻油、玉米油、橄欖油、綿實油等。作為溶解補助劑的較佳例子

，可舉出聚乙二醇、丙二醇、D-甘露醇、海藻糖、安息香酸苯甲酯、乙醇、參胺基甲烷、膽固醇、三乙醇胺、碳酸鈉、檸檬酸鈉、水楊酸鈉、乙酸鈉等。作為懸浮化劑的較佳例子，可舉出硬脂醯基三乙醇胺、月桂基硫酸鈉、月桂基胺基丙酸、卵磷脂、氯化苯二甲烴鉍、氯化苯鉍松寧、單硬脂酸甘油酯等界面活性劑；例如可舉出聚乙烯基醇、聚乙烯基吡咯烷酮、羧基甲基纖維素鈉、甲基纖維素、羥基甲基纖維素、羥基乙基纖維素、羥基丙基纖維素等親水性高分子；聚山梨酯類、聚環氧乙烷硬化蓖麻油等。作為等張化劑的較佳例子，可舉出氯化鈉、甘油、D-甘露醇、D-山梨糖醇、葡萄糖等。作為緩衝劑的較佳例子，可舉出磷酸鹽、乙酸鹽、碳酸鹽、檸檬酸鹽等緩衝液等。作為無痛化劑的較佳例子，可舉出苯甲醇等。作為防腐劑的較佳例子，可舉出對氧安息香酸酯類、氯丁醇、苯甲醇、苯乙基醇、脫氫乙酸、山梨酸等。作為抗氧化劑的較佳例子，可舉出亞硫酸鹽、抗壞血酸鹽等。作為著色劑的較佳例子，可舉出水溶性食用 tar dye(例如食用紅色 2 號及 3 號、食用黃色 4 號及 5 號、食用藍色 1 號及 2 號等食用色素、水不溶性色淀(Lake)色素(例如前述水溶性食用 tar dye 的鋁鹽等)、天然色素(例如 β -胡蘿蔔素、葉綠素、鐵丹等)等。

又，注射劑係將有效成分與分散劑(例如聚山梨酯 80、聚環氧乙烷硬化蓖麻油 60 等，聚乙二醇、羧基甲基纖維素、褐藻酸鈉等)、保存劑(例如對羥苯甲酸甲酯、對羥

苯甲酸丙酯、苯甲醇、氯丁醇、酚等)、等張化劑(例如氯化鈉、甘油、D-甘露醇、D-山梨糖醇、葡萄糖等)等同時溶解、懸浮或乳化於水性溶劑(例如蒸餾水、生理的食鹽水、林格氏液等)或油性溶劑(例如橄欖油、芝麻油、綿實油、玉米油等植物油、丙二醇等)而製造。此時，依所需可使用溶解補助劑(例如水楊酸鈉，乙酸鈉等)、安定劑(例如人類血清白蛋白等)、無痛化劑(例如苯甲醇等)等添加物。注射液一般可填充於適當安瓶。

本發明的防除有害生物之組成物亦可作為緩釋性製劑使用。作為該緩釋性製劑，例如可藉由水中乾燥法(o/w法、w/o/w法等)、相分離法、噴霧乾燥法或依據這些方法所製造之微膠囊(例如微球體、微膠囊、微顆粒等)、活體適合性聚合物所成形者等。

本發明的防除有害生物之組成物可與其他殺蟲劑、殺線蟲劑、殺蟎劑、殺菌劑、除草劑、植物生長調節劑、共力劑、肥料、土壤改良劑、動物用飼料等混用或併用。

【實施方式】

[實施例]

以下為本發明製造本醯肼化合物及本醯肼化合物的製造中間體之例子，藉由本發明的防除有害生物之組成物之製劑例及試驗例做更詳細說明，本發明並未受到這些例子的限定。

且，本說明書中所使用之簡稱具有以下意思。

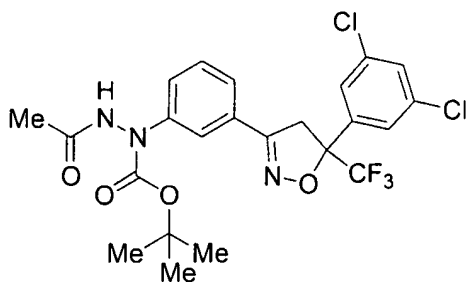
Me：甲基、Et：乙基、Ph：苯基。

首先，本醯肼化合物的製造例如以下所示。

製造例 1

將在參考製造例 6 所得之 N-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 1.39g 及三乙基胺 330mg 溶解於四氫呋喃 12ml，於此在 0℃ 滴入氯化乙醯 257mg，在 0℃ 進行 1 小時攪拌後，在室溫進行 13 小時靜置。於反應混合物加入水，並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-乙醯基-N-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯(本說明書中記載為本醯肼化合物(1))1.30g。

本醯肼化合物(1)



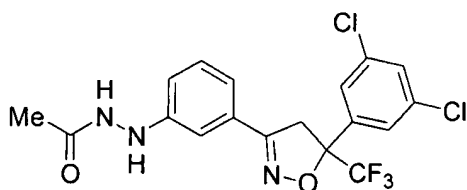
熔點：111℃

製造例 2

將在製造例 1 所得之 N'-乙醯基-N-{3-[5-(3,5-二氯苯

基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 250mg 溶解於四氫呋喃 1ml，於此在室溫滴入三氟乙酸 1.5mL，並進行 1 小時攪拌。於反應混合物中加入飽和碳酸氫鈉水溶液，並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}乙醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(2))179mg。

本醯肼化合物(2)



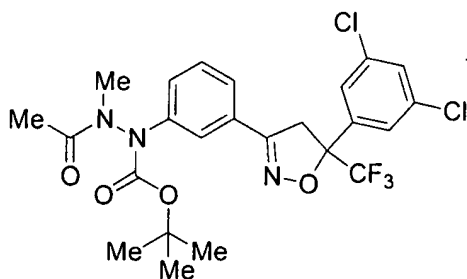
熔點：100℃

製造例 3

將氫化鈉(60%油性)78mg 懸浮於四氫呋喃 4mL，於此在室溫滴入溶解製造例 1 所得之 N'-乙醯基-N-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 800mg 於四氫呋喃 6ml 的溶液。在同溫進行 30 分鐘攪拌後，於此在室溫加入碘化甲基 355mg，在同溫進行 10 小時攪拌。於混合物加入飽和碳酸氫鈉水溶液並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-乙醯基-N'-甲基-N-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二

氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯(本說明書中記載為本醯肼化合物(3))697mg。

本醯肼化合物(3)

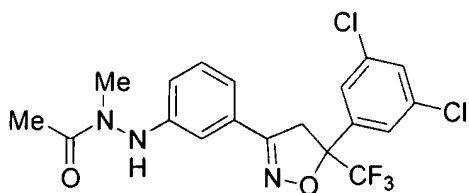


熔點：79℃

製造例 4

於製造例 3 所得之 N'-乙醯基-N'-甲基-N-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 324mg 在室溫加入三氟乙酸 5mL，在同溫進行 30 分鐘攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，於殘渣加入乙酸乙酯，將有機層以飽和碳酸氫鈉水溶液進行洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N-甲基-N'-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}乙醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(4))290mg。

本醯肼化合物(4)

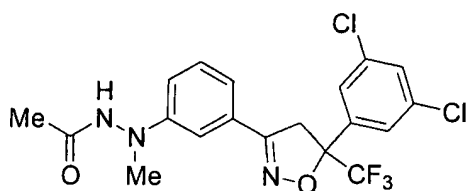


熔點：88℃

製造例 5

將在參考製造例 10 所得之粗製物的 N-甲基-N-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}聯胺 1.00g 及三乙基胺 180mg 溶解於四氫呋喃 3ml，於此在 0℃ 滴入氯化乙醯 139mg，同溫下進行 1 小時攪拌。於反應混合物中加入飽和碳酸氫鈉水溶液，並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-甲基-N'-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}乙醯肼 (本說明書中記載為本醯肼化合物 (5)) 498mg。

本醯肼化合物 (5)



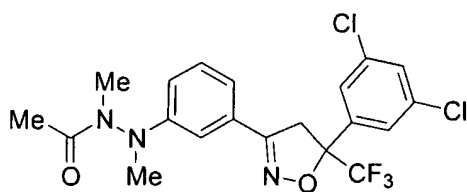
熔點：87℃

製造例 6

將在製造例 5 所得之 N'-甲基-N'-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}乙醯肼 248mg 溶解於 N,N-二甲基甲醯胺 2mL，於此在室溫加入碳酸鈉 92mg、碘化甲基 87mg。在同溫進行 5 小時攪拌後，加入第三丁基甲基醚 20mL，過濾沈澱物。將濾液減壓下濃縮

，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N-甲基-N'-甲基-N'-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}乙醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(6))140mg。

本醯肼化合物(6)

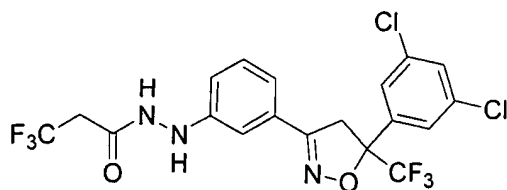


熔點：151℃

製造例 7

將在參考製造例 3 所得之粗製物的 3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基聯胺 1.04g 及三乙基胺 269mg 溶解於四氫呋喃 5ml，於此在 0℃ 滴入 3,3,3-三氟丙醯基氯化物 391mg，在室溫進行 4 小時攪拌。於反應混合物中加入飽和碳酸氫鈉水溶液，並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}-3,3,3-三氟丙醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(7))639mg。

本醯肼化合物(7)

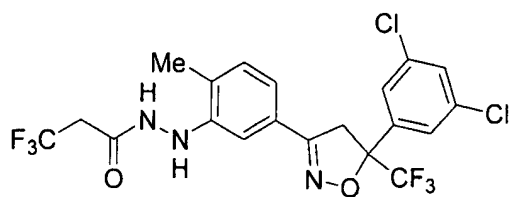


熔點：75℃

製造例 8

將在參考製造例 14 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-甲基苯基聯胺 220mg 及吡啶 43mg 溶解於乙酸乙酯 2ml，於此在 0℃ 滴入 3,3,3-三氟丙醯基氯化物 80mg，在室溫進行 4 小時攪拌。於反應混合物加入水，並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-甲基苯基}-3,3,3-三氟丙醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(8))162mg。

本醯肼化合物(8)

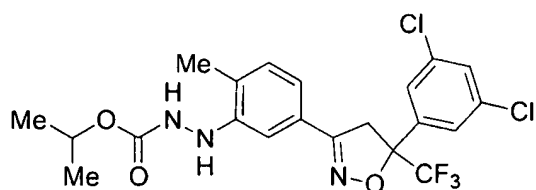


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 8.01-7.96(1H, brm), 7.48-7.42(3H, m), 7.15-7.04(3H, m), 6.11-6.00(1H, m), 4.04-4.00(1H, m), 3.63(1H, d, $J=17.1\text{Hz}$), 3.25-3.19(2H, m), 2.26(3H, s)。

製造例 9

將在參考製造例 14 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-甲基苯基聯胺 220mg 及吡啶 43mg 溶解於乙酸乙酯 2ml，於此在 0℃ 滴入氯甲酸異丙基 80mg，在室溫進行 4 小時攪拌。於反應混合物加入水，並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-甲基苯基}肼基甲酸異丙基(本說明書中記載為本醯肼化合物(9))127mg。

本醯肼化合物(9)



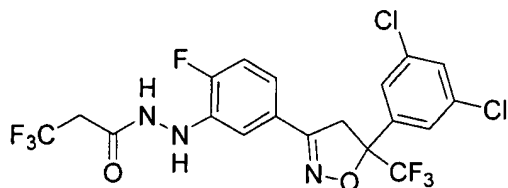
熔點：71℃

製造例 10

將在參考製造例 18 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 412mg 及三乙基胺 102mg 溶解於四氫呋喃 6ml，於此在 0℃ 滴入 3,3,3-三氟丙醯基氯化物 148mg，在室溫進行 4 小時攪拌。於反應混合物中加入飽和碳酸氫鈉水溶液，並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-

(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氟苯基}-3,3,3-三氟丙醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(10))167mg。

本醯肼化合物(10)



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 7.89-7.55(1H, m), 7.46-7.42(3H, m), 7.28(1H, dd, $J=7.9, 1.8\text{Hz}$), 7.18-7.00(2H, m), 6.39-6.29(1H, m), 4.03-3.98(1H, m), 3.65-3.60(1H, m), 3.21(2H, q, $J=10.3\text{Hz}$)。

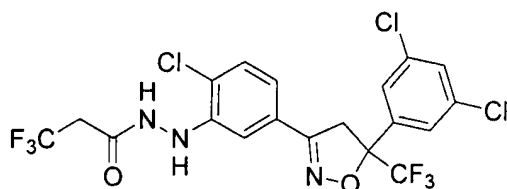
製造例 11

將在參考製造例 21 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 510 mg 及三乙基胺 123mg 溶解於四氫呋喃 6ml，於此在 0℃ 滴入 3,3,3-三氟丙醯基氯化物 179mg，在室溫進行 2.5 小時攪拌。於反應混合物中加入飽和碳酸氫鈉水溶液，並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。

將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基}-3,3,3-三氟丙醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物

(11))175 mg。

本醯肼化合物(11)

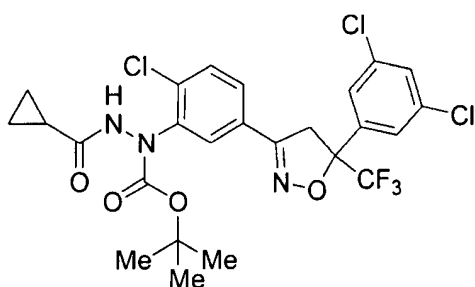


熔點 89℃

製造例 12

將在參考製造例 23 所得之 N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 110mg 及三乙基胺 22mg 溶解於四氫呋喃 2ml，於此在 0℃ 滴入環丙烷羰基氯化物 23mg，在室溫進行 1 小時攪拌。於反應混合物加入水，並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-環丙烷羰基-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯(本說明書中記載為本醯肼化合物(12))101mg。

本醯肼化合物(12)

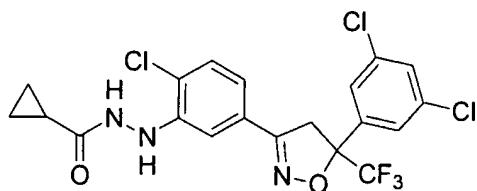


熔點：180℃

製造例 13

製造例 12 所得之 N'-環丙烷羰基-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 272mg 在室溫加入三氟乙酸 2mL，同溫下進行 1 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，於殘渣加入乙酸乙酯，以飽和碳酸氫鈉水溶液洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}環丙烷甲醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(13))214mg。

本醯肼化合物(13)



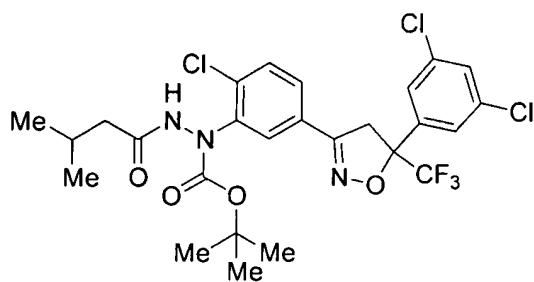
熔點 100℃

製造例 14

將在參考製造例 23 所得之 N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 262mg 及三乙基胺 61mg 溶解於四氫呋喃 2ml，於此在 0℃滴入異戊醯氯氧化物 72mg，在室溫進行 9 小時攪拌。於反應混合物加入水，並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽

膠管柱層析，得到 N'-異戊醯-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯(本說明書中記載為本醯肼化合物(14))280mg。

本醯肼化合物(14)

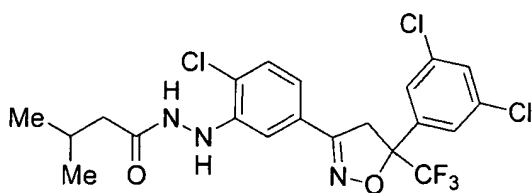


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 7.82-7.70(3H, m), 7.48-7.44(4H, m), 4.08-4.04(1H, m), 3.71-3.66(1H, m), 2.18-2.10(3H, m), 1.45(9H, d, $J=52.9\text{Hz}$), 0.98(6H, d, $J=6.1\text{Hz}$)。

製造例 15

於製造例 14 所得之 N'-異戊醯-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 280mg 在室溫加入三氟乙酸 2mL，在同溫進行 2 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，於殘渣加入乙酸乙酯，將有機層以飽和碳酸氫鈉水溶液進行洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}異戊醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(15))222mg。

本醯肼化合物(15)

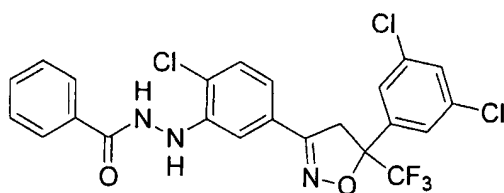


熔點：84℃

製造例 16

將在參考製造例 21 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 200mg 及三乙基胺 57mg 溶解於四氫呋喃 1.5ml，於此在 0℃ 滴入苯甲醯基氯化物 79mg，在室溫進行 2 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基}苯並醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(16))220mg。

本醯肼化合物(16)



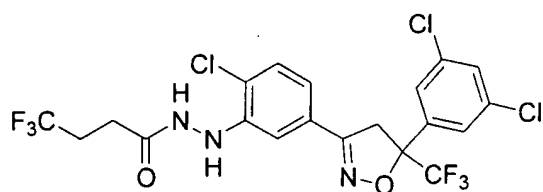
熔點 105℃

製造例 17

將在參考製造例 21 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 200

mg 及三乙基胺 57mg 溶解於四氫呋喃 2ml，於此在 0℃ 滴入 4,4,4-三氟丁醯基氯化物 90mg，在室溫進行 2 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基}-4,4,4-三氟丁醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(17))201mg。

本醯肼化合物(17)

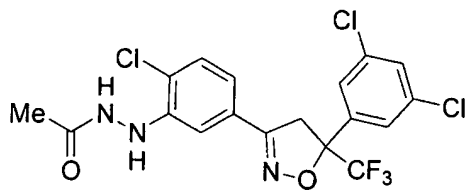


熔點 82℃

製造例 18

將在參考製造例 21 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 200mg 及三乙基胺 57mg 溶解於四氫呋喃 4ml，於此在 0℃ 滴入氯化乙醯 44mg，室溫進行 2 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基}乙醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(18))168mg。

本醯肼化合物(18)

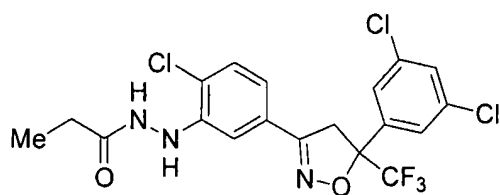


熔點：94℃

製造例 19

將在參考製造例 21 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 200mg 及三乙基胺 57mg 溶解於四氫呋喃 4ml，於此在 0℃ 滴入丙醯基氯化物 52mg，在室溫進行 2 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基}丙醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(19))195mg。

本醯肼化合物(19)



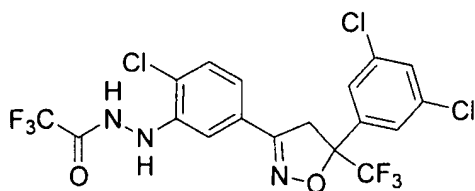
熔點 92℃

製造例 20

將在參考製造例 21 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 260mg 及三乙基胺 60mg 溶解於四氫呋喃 2ml，於此在 0℃

滴入三氟乙酸酐 150mg，在室溫進行 2 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基}-2,2,2-三氟乙醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(20))175mg。

本醯肼化合物(20)

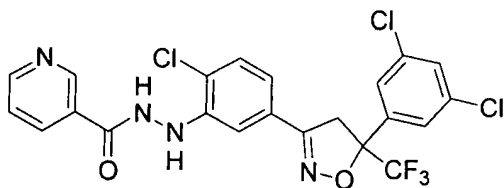


熔點：64℃

製造例 21

將在參考製造例 21 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 200mg 及三乙基胺 95mg 溶解於四氫呋喃 4ml，於此在 0℃ 加入煙醯基氯化物鹽酸鹽 84mg，在室溫進行 2 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基}煙醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(21))198mg。

本醯肼化合物(21)

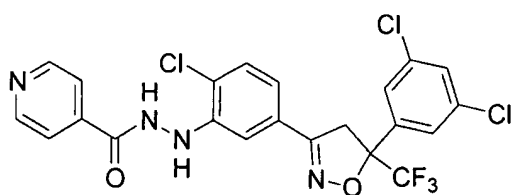


熔點：205℃

製造例 22

將在參考製造例 21 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 200mg 及三乙基胺 95mg 溶解於四氫呋喃 4ml，於此在 0℃ 加入異煙醯基氯化物鹽酸鹽 84mg，在室溫進行 2 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基}異煙醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(22))169mg。

本醯肼化合物(22)



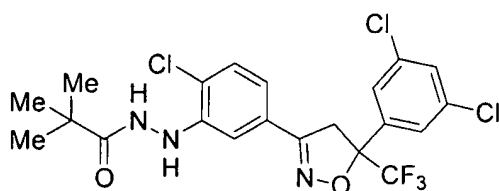
熔點：115℃

製造例 23

將在參考製造例 21 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 200mg 及三乙基胺 52mg 溶解於四氫呋喃 4ml，於此在 0℃ 加

入戊醯基氯化物 62mg，在室溫進行 2 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基}戊醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(23))198mg。

本醯肼化合物(23)

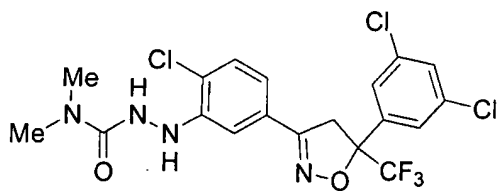


熔點：106℃

製造例 24

將在參考製造例 21 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 200mg 及三乙基胺 57mg 溶解於四氫呋喃 4ml，於此在 0℃加入二甲基胺基甲醯基氯化物 67mg，在室溫進行 2 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 4,4-二甲基-1-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基}胺脲(本說明書中記載為本醯肼化合物(24))70mg。

本醯肼化合物(24)

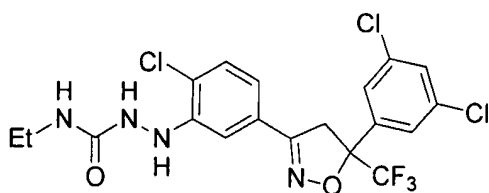


熔點：212℃

製造例 25

將在參考製造例 21 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 200 mg 及三乙基胺 51mg 溶解於四氫呋喃 4ml，於此在 0℃加入異氰酸乙基 37mg，在室溫進行 2 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 4-乙基-1-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基}胺脲(本說明書中記載為本醯肼化合物(25))149mg。

本醯肼化合物(25)



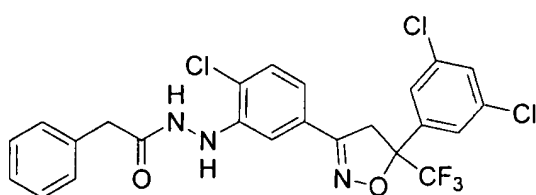
熔點：102℃

製造例 26

將在參考製造例 21 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 200 mg 及三乙基胺 57mg 溶解於四氫呋喃 4ml，於此在 0℃加

入苯基乙醯基氯化物 79mg，在室溫進行 2 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基}苯基乙醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(26))211mg。

本醯肼化合物(26)

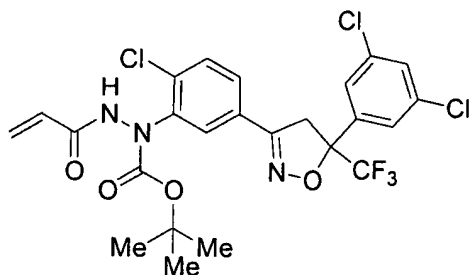


熔點：173℃

製造例 27

將在參考製造例 23 所得之 N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 500mg 及丙烯酸 122mg 溶解於 N,N-二甲基甲醯胺 2 ml，於此在室溫加入 1-乙基-3-(3-二甲基胺基丙基)碳二亞胺鹽酸鹽 319mg，進行 3 小時攪拌。於反應混合物加入水，並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-丙烯醯基-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯(本說明書中記載為本醯肼化合物(27))384mg。

本醯肼化合物(27)

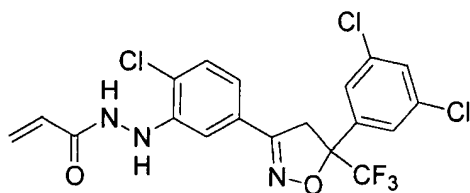


熔點：119℃

製造例 28

於在製造例 27 所得之 N'-丙烯醯基-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 309mg 在室溫加入三氟乙酸 2mL，在同溫進行 2 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，於殘渣加入乙酸乙酯，將有機層以飽和碳酸氫鈉水溶液進行洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}丙烯醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(28))238mg。

本醯肼化合物(28)



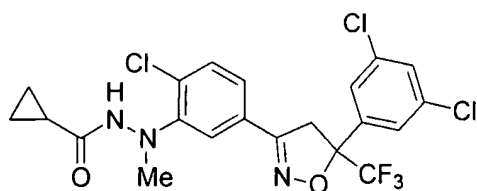
熔點：90℃

製造例 29

將在參考製造例 28 所得之 N-甲基-N-{2-氯-5-[5-(3,5-

二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}聯胺 200mg 及三乙基胺 57mg 溶解於四氫呋喃 2.0mL，於此在室溫滴入環丙烷羰基氯化物 58mg。在同溫進行 30 分鐘攪拌後，將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-甲基-N'-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}環丙烷甲醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(29))225mg。

本醯肼化合物(29)

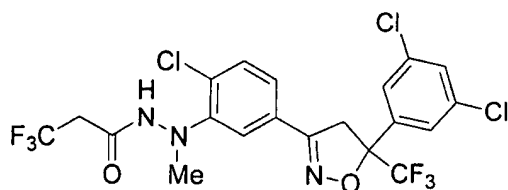


熔點：176℃

製造例 30

將在參考製造例 28 所得之 N-甲基-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}聯胺 200mg 及三乙基胺 57mg 溶解於四氫呋喃 2.0mL，於此在室溫滴入 3,3,3-三氟丙醯基氯化物 81mg。在同溫進行 30 分鐘攪拌後，將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-甲基-N'-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}-3,3,3-三氟丙醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(30))241mg。

本醯肼化合物(30)

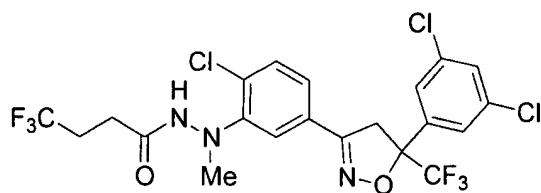


熔點：81℃

製造例 31

將在參考製造例 28 所得之 N-甲基-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}聯胺 200mg 及三乙基胺 57mg 溶解於四氫呋喃 2.0mL，於此在室溫滴入 4,4,4-三氟丁醯基氯化物 88mg。在同溫進行 1 小時攪拌後，將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-甲基-N'-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}-4,4,4-三氟丁醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(31))258mg。

本醯肼化合物(31)



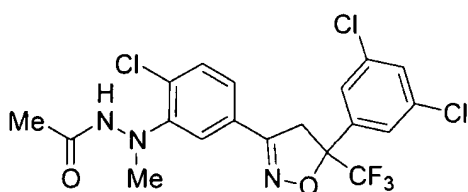
熔點：77℃

製造例 32

將在參考製造例 28 所得之 N-甲基-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}聯胺

200mg 及三乙基胺 57mg 溶解於四氫呋喃 2.0mL，於此在室溫滴入氯化乙醯 43mg。在同溫進行 1 小時攪拌後，將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-甲基-N'-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}乙醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(32))204mg。

本醯肼化合物(32)

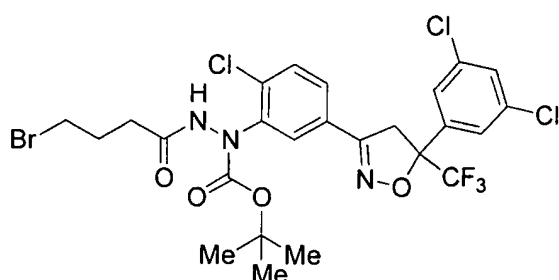


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 7.88-7.24(7H, m), 4.09-4.04(1H, m), 3.70-3.66(1H, m), 3.29-3.07(3H, m), 2.17-1.91(3H, m)。

製造例 33

將在參考製造例 23 所得之 N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 525mg 及三乙基胺 121mg 溶解於四氫呋喃 4ml，於此在室溫滴入 4-溴丁醯基氯化物 223mg，進行 1 小時攪拌。於反應混合物加入水，以乙酸乙酯萃取。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮，得到粗製物的 N'-(4-溴丁醯基)-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯(本說明書中記載為本醯肼化合物(33))699mg。

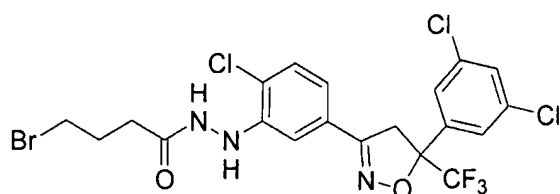
本醯肼化合物 (33)



製造例 34

於在製造例 33 所得之 N'-(4-溴丁醯基)-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 309mg 加入三氟乙酸 2mL 並在室溫進行 2 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，於殘渣加入乙酸乙酯，將有機層以飽和碳酸氫鈉水溶液進行洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}-4-溴丁醯肼 (本說明書中記載為本醯肼化合物 (34)) 573mg。

本醯肼化合物 (34)

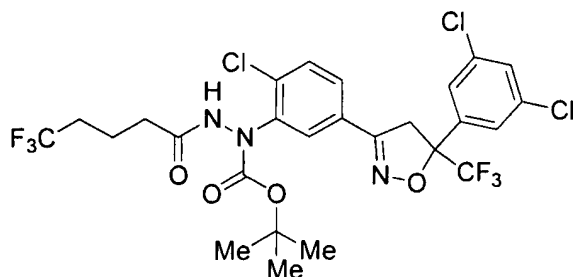


熔點：59℃

製造例 35

將在參考製造例 23 所得之 N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 350mg 及 5,5,5-三氟戊酸 187mg 溶解於 N,N-二甲基甲醯胺 2ml，於此在室溫加入 1-乙基-3-(3-二甲基胺基丙基)碳二亞胺鹽酸鹽 153mg，進行 3 小時攪拌。於反應混合物加入水，並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮，得到粗製物的 N'-(5,5,5-三氟戊醯基)-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯(本說明書中記載為本醯肼化合物(35))350mg。

本醯肼化合物(35)

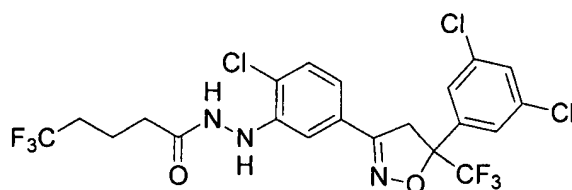


製造例 36

於在製造例 35 所得之粗製物的 N'-(5,5,5-三氟戊醯基)-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 350mg 在室溫加入三氟乙酸 2mL，在同溫進行 2 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，於殘渣加入乙酸乙酯，將有機層以飽和碳酸氫鈉水溶液進行洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減

壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}-5,5,5-三氟戊醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(36))269mg。

本醯肼化合物(36)

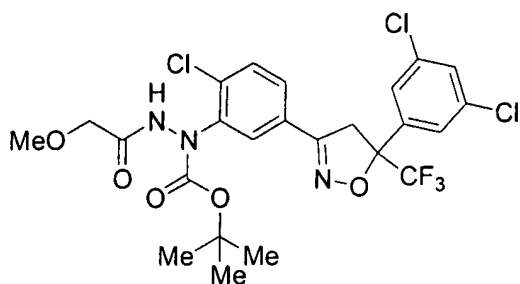


熔點：163℃

製造例 37

將在參考製造例 23 所得之 N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 367mg 及三乙基胺 84mg 溶解於四氫呋喃 2ml，於此在室溫滴入甲氧基乙醯基氯化物 91mg，進行 1 小時攪拌。於反應混合物加入乙酸乙酯，將有機層以水洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮，得到粗製物的 N'-甲氧基乙醯基-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯(本說明書中記載為本醯肼化合物(37))377mg。

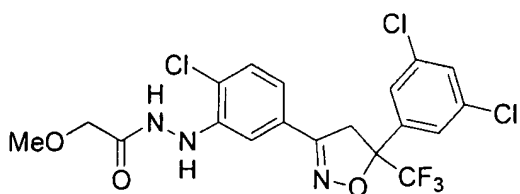
本醯肼化合物(37)



製造例 38

於在製造例 37 所得之粗製物的 N'-甲氧基乙醯基-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 309mg 在室溫加入三氟乙酸 2mL，在同溫進行 2 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，於殘渣加入乙酸乙酯，將有機層以飽和碳酸氫鈉水溶液進行洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}甲氧基乙醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(38))276mg。

本醯肼化合物(38)



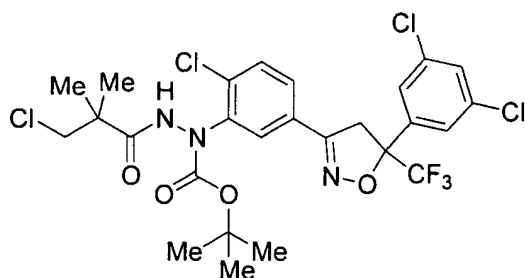
熔點：178℃

製造例 39

將在參考製造例 23 所得之 N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯

基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 524mg 及三乙基胺 121mg 溶解於四氫呋喃 4ml，於此在室溫滴入 3-氯戊醯基氯化物 186mg，同溫下進行 1 小時攪拌。於反應混合物加入乙酸乙酯，將有機層以水洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮，得到粗製物的 N'-(3-氯戊醯基)-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯(本說明書中記載為本醯肼化合物(39))643mg。

本醯肼化合物(39)

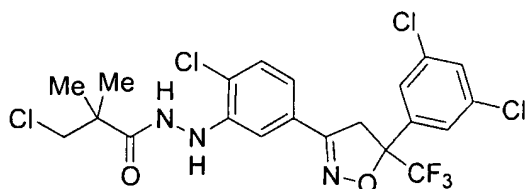


製造例 40

於在製造例 39 所得之粗製物的 N'-(3-氯戊醯基)-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 643mg 加入三氟乙酸 5mL，在室溫進行 2 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，於殘渣加入乙酸乙酯，將有機層以飽和碳酸氫鈉水溶液進行洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮後，得到 N'-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}-3-氯戊醯肼(本說明書中記載為本醯肼

化合物(40))520mg。

本醯肼化合物(40)

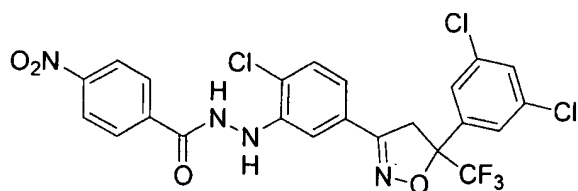


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 7.68(1H, d, $J=3.2\text{Hz}$), 7.47(2H, d, $J=1.7\text{Hz}$), 7.42(1H, t, $J=2.0\text{Hz}$), 7.32(1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.26(1H, d, $J=1.5\text{Hz}$), 7.06(1H, dd, $J=8.2, 2.1\text{Hz}$), 6.45(1H, d, $J=3.2\text{Hz}$), 4.00(1H, d, $J=17.6\text{Hz}$), 3.68(2H, s), 3.63(1H, d, $J=17.6\text{Hz}$), 1.42(3H, s), 1.41(3H, s)。

製造例 41

將在參考製造例 21 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 200 mg 及三乙基胺 56mg 溶解於四氫呋喃 4ml，於此在 0°C 加入 4-硝基苯甲醯基氯化物 103mg，在室溫進行 10 分鐘攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基}-4-硝基苯並醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(41))166mg。

本醯肼化合物(41)

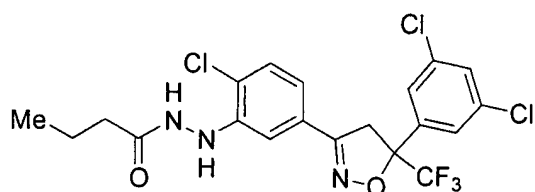


熔點：231℃

製造例 42

將在參考製造例 21 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 200 mg 及三乙基胺 57mg 溶解於四氫呋喃 4ml，於此在 0℃加入丁醯基氯化物 50mg，在室溫進行 20 分鐘攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基}丁醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(42))121mg。

本醯肼化合物(42)



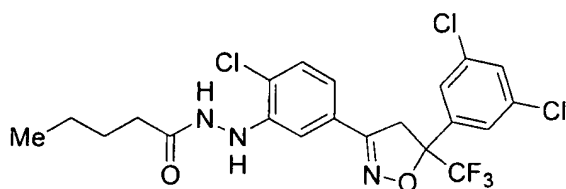
熔點：82℃

製造例 43

將在參考製造例 21 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 200 mg 及三乙基胺 57mg 溶解於四氫呋喃 4ml，於此在 0℃加

入戊醯基氯化物 57mg，在室溫進行 2 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基}戊醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(43))164mg。

本醯肼化合物(43)

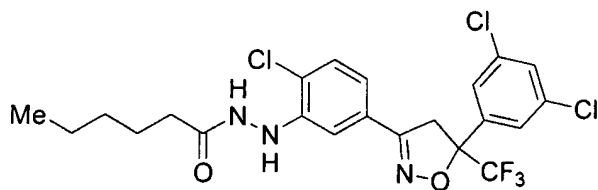


熔點：89℃

製造例 44

將在參考製造例 21 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 200mg 及三乙基胺 57mg 溶解於四氫呋喃 4ml，於此在 0℃加入己醯基氯化物 63mg，在室溫進行 20 分鐘攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基}己醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(44))134mg。

本醯肼化合物(44)

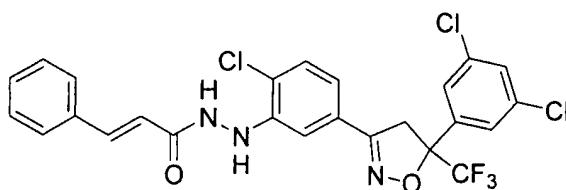


熔點：80℃

製造例 45

將在參考製造例 21 所得之粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 200 mg 及三乙基胺 57mg 溶解於四氫呋喃 4ml，於此在 0℃加入肉桂醯基氯化物 78mg，在室溫進行 20 分鐘攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基}-3-苯基丙烯醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(45))161mg。

本醯肼化合物(45)



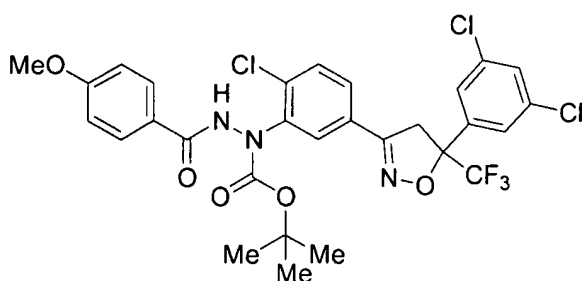
熔點：205℃

製造例 46

將在參考製造例 23 所得之 N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 247mg 及三乙基胺 56mg 溶解於四氫呋喃 2mL，於此

在室溫加入 4-甲氧基苯甲醯基氯化物 95mg，進行 1 小時攪拌。於反應混合物加入乙酸乙酯，將有機層以水洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮，得到粗製物的 N'-(4-甲氧基苯甲醯基)-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 (本說明書中記載為本醯肼化合物(46))240mg。

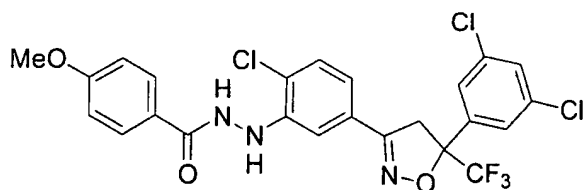
本醯肼化合物(46)



製造例 47

於在製造例 46 所得之粗製物的 N'-(4-甲氧基苯甲醯基)-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 240mg 加入三氟乙酸 2 mL，並在室溫進行 1 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，於殘渣加入乙酸乙酯，將有機層以飽和碳酸氫鈉水溶液進行洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮後，得到 N'-(4-甲氧基苯甲醯基)-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 (本說明書中記載為本醯肼化合物(47))221mg。

本醯肼化合物(47)

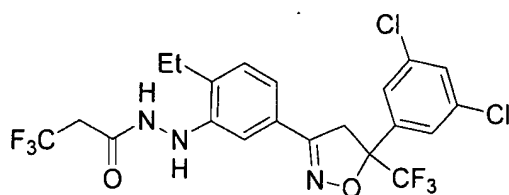


熔點：131℃

製造例 48

將在參考製造例 31 所得之 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-乙基苯基聯胺 1.31g 及三乙基胺 200mg 溶解於四氫呋喃 4ml，於此在室溫滴入 3,3,3-三氟丙醯基氯化物 290mg。在同溫進行 1 小時攪拌後，將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N'-{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-乙基苯基}-3,3,3-丙醯肼(本說明書中記載為本醯肼化合物(48))426mg。

本醯肼化合物(48)



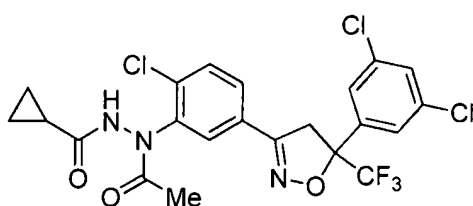
熔點 138.7℃

製造例 49

將在參考製造例 33 所得之化合物 200mg 及三乙基胺 65mg 溶解於四氫呋喃 2ml，於此在室溫滴入環丙烷羰基氯

化物 54mg，同溫下進行 1 小時攪拌。於反應混合物加入乙酸乙酯，將有機層以水洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到下述式所示化合物(本說明書中記載為本醯肼化合物(49))216mg。

本醯肼化合物(49)

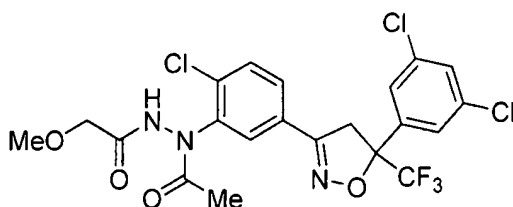


熔點：160℃

製造例 50

將在參考製造例 33 所得之化合物 200mg 及三乙基胺 65mg 溶解於四氫呋喃 2ml，於此在室溫滴入甲氧基乙醯基氯化物 55mg，同溫下進行 1 小時攪拌。於反應混合物加入乙酸乙酯，將有機層以水洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到下述式所示化合物(本說明書中記載為本醯肼化合物(50))130mg。

本醯肼化合物(50)

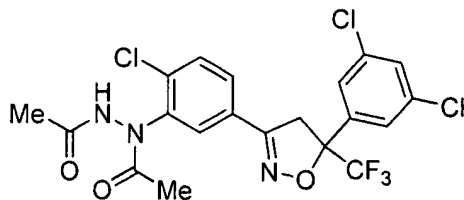


熔點：164℃

製造例 51

將在參考製造例 33 所得之化合物 200mg 及三乙基胺 65mg 溶解於四氫呋喃 2ml，於此在室溫滴入氯化乙醯 40mg，同溫下進行 1 小時攪拌。於反應混合物加入乙酸乙酯，將有機層以水洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到下述式所示化合物（本說明書中記載為本醯肼化合物（51））140mg。

本醯肼化合物（51）



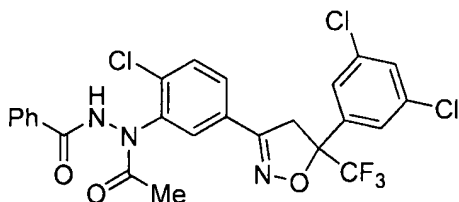
熔點：108℃

製造例 52

將在參考製造例 33 所得之化合物 200mg 及三乙基胺 65mg 溶解於四氫呋喃 2ml，於此在室溫滴入苯甲醯基氯化物 72mg，同溫下進行 1 小時攪拌。於反應混合物加入乙酸乙酯，將有機層以水洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到下述式所示化合物（本說明書中記載為本醯肼化合物

(52))281mg。

本醯肼化合物(52)

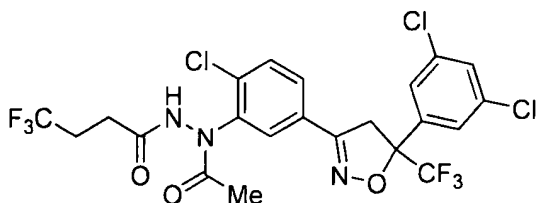


熔點：107℃

製造例 53

將在參考製造例 33 所得之化合物 200mg 及三乙基胺 65mg 溶解於四氫呋喃 2ml，於此在室溫滴入 4,4,4-三氟丁醯基氯化物 90mg，同溫下進行 1 小時攪拌。於反應混合物加入乙酸乙酯，將有機層以水洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到下述式所示化合物(本說明書中記載為本醯肼化合物(53))207mg。

本醯肼化合物(53)

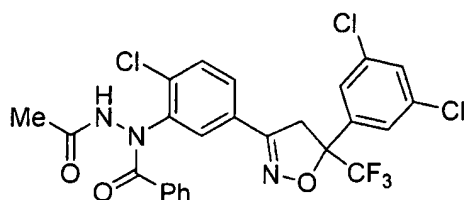


熔點：117℃

製造例 54

將在參考製造例 35 所得之化合物 200mg 及三乙基胺 58mg 溶解於四氫呋喃 2ml，於此在室溫滴入氯化乙醯 38mg，同溫下進行 1 小時攪拌。於反應混合物加入乙酸乙酯，將有機層以水洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到下述式所示化合物(本說明書中記載為本醯肼化合物(54)) 156mg。

本醯肼化合物(54)

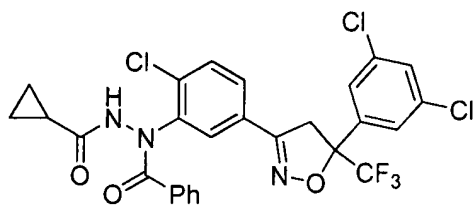


熔點：142℃

製造例 55

將在參考製造例 35 所得之化合物 200mg 及三乙基胺 51mg 溶解於四氫呋喃 2ml，於此在室溫滴入環丙烷羰基氯化物 54mg，同溫下進行 1 小時攪拌。於反應混合物加入乙酸乙酯，將有機層以水洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到下述式所示化合物(本說明書中記載為本醯肼化合物(55))103mg。

本醯肼化合物(55)

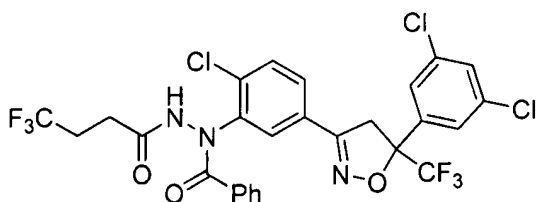


熔點：172℃

製造例 56

將在參考製造例 35 所得之化合物 200mg 及三乙基胺 65mg 溶解於四氫呋喃 2ml，於此在室溫滴入 4,4,4-三氟丁醯基氯化物 78mg，同溫下進行 1 小時攪拌。於反應混合物加入乙酸乙酯，將有機層以水洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到下述式所示化合物(本說明書中記載為本醯肼化合物(56))211mg。

本醯肼化合物(56)



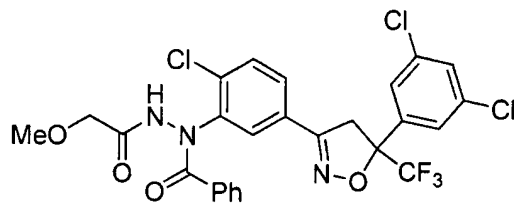
熔點：157℃

製造例 57

將在參考製造例 35 所得之化合物 300mg 及三乙基胺 85mg 溶解於四氫呋喃 2ml，於此在室溫滴入甲氧基乙醯基氯化物 79mg，同溫下進行 1 小時攪拌。於反應混合物加入乙酸乙酯，將有機層以水洗淨。將有機層以無水硫酸鈉

乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到下述式所示化合物(本說明書中記載為本醯肼化合物(57))297mg。

本醯肼化合物(57)

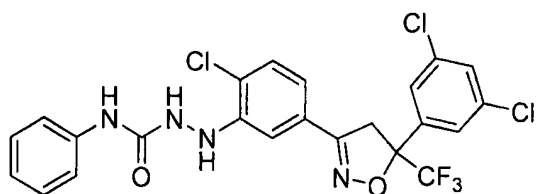


熔點：92℃

製造例 58

將在參考製造例 21 所得之粗製物的化合物 241mg 溶解於四氫呋喃 2ml，於此在室溫滴入苯基異氰酸酯 82mg，在室溫進行 3 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到下述式所示化合物(本說明書中記載為本醯肼化合物(58))187mg。

本醯肼化合物(58)

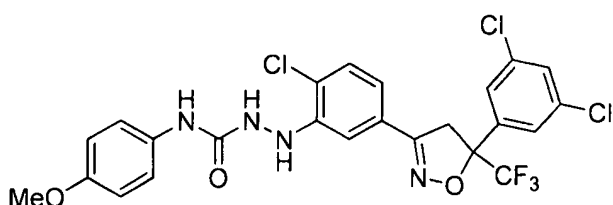


熔點 131℃

製造例 59

將在參考製造例 21 所得之粗製物的化合物 200mg 溶解於四氫呋喃 6ml，於此在室溫滴入 4-甲氧基苯基異氰酸酯 85mg，在室溫進行 3 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到下述式所示化合物(本說明書中記載為本醯肼化合物(59))191mg。

本醯肼化合物(59)

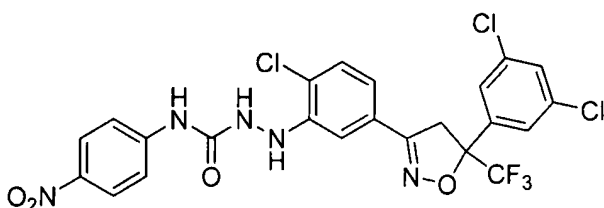


熔點 131℃

製造例 60

將在參考製造例 21 所得之粗製物的化合物 196mg 溶解於四氫呋喃 5ml，於此在室溫滴入 4-硝基苯基異氰酸酯 136mg，在室溫進行 3 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到下述式所示化合物(本說明書中記載為本醯肼化合物(60))110mg。

本醯肼化合物(60)

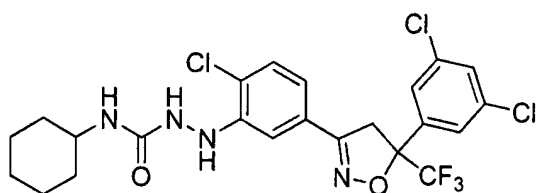


熔點 201℃

製造例 61

將在參考製造例 21 所得之粗製物的化合物 220mg 溶解於四氫呋喃 6ml，於此在室溫滴入環己基異氰酸酯 79mg，在室溫進行 3 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到下述式所示化合物(本說明書中記載為本醯肼化合物(61))100mg。

本醯肼化合物(61)

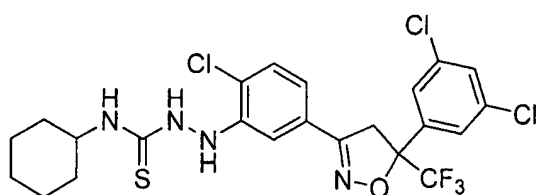


熔點 101℃

製造例 62

將在參考製造例 21 所得之粗製物的化合物 340mg 溶解於四氫呋喃 6ml，於此在室溫滴入環己基異硫氰酸酯 173mg，在室溫進行 3 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到下述式所示化合物(本說明書中記載為本醯肼化合物(62))135mg。

本醯肼化合物(62)

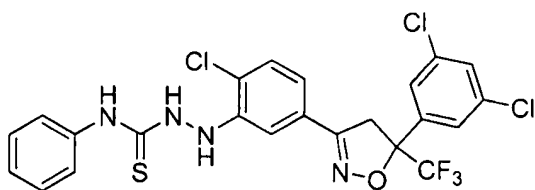


熔點 126℃

製造例 63

將在參考製造例 21 所得之粗製物的化合物 240mg 溶解於四氫呋喃 6ml，於此在室溫滴入苯基異硫氰酸酯 114mg，在室溫進行 3 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到下述式所示化合物(本說明書中記載為本醯肼化合物(63))200mg。

本醯肼化合物(63)



熔點 213℃

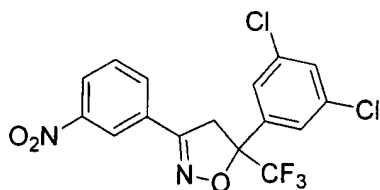
其次說明對於製造中間體之製造的參考製造例。

參考製造例 1

將 3-硝基苯甲醛肟 249mg 溶解於 N,N-二甲基甲醯胺 15ml，於此在室溫加入 N-氯琥珀醯亞胺 201mg，在 60℃ 進行 1 小時攪拌。於冷卻至室溫的反應液中，加入 2-(3,5-二氯苯基)-3,3,3-三氟-1-丙烯 362mg，再加入三乙基胺 152mg，在室溫進行 6 小時攪拌。於反應混合物加入水，並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 3-[5-

(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]硝基苯
232mg。

3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]硝基苯

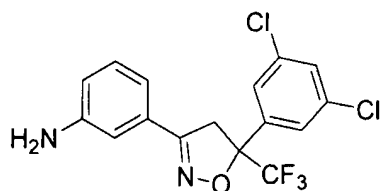


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 8.43(1H, br s), 8.34-8.32(1H, m), 8.10(1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.67-7.65(1H, m), 7.52(2H, s), 7.45-7.45(1H, m), 4.14(1H, d, $J=17.3\text{Hz}$), 3.76(1H, d, $J=17.3\text{Hz}$)。

參考製造例 2

於 2.5%乙酸水溶液 1ml 加入鐵粉(10~20 篩子)192mg，於此在 75℃加入在參考製造例 1 所製造之 3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]硝基苯 232mg 的乙醇 1.5ml 懸浮液，在同溫進行 15 分鐘攪拌後，再加入鐵粉 300mg，在室溫進行 1 小時攪拌。冷卻至室溫的反應混合物經過濾，並以乙酸乙酯洗淨。於濾液加入水與乙酸乙酯進行萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯胺 198mg。

3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯胺



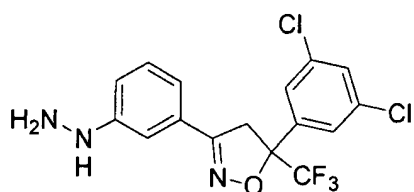
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 7.51(2H, br s), 7.42(1H, t, $J=1.9\text{Hz}$), 7.20(1H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 7.04(1H, t, $J=1.9\text{Hz}$), 6.95-6.93(1H, m), 6.77-6.75(1H, m), 4.05(1H, d, $J=17.1\text{Hz}$), 3.77(2H, br s), 3.66(1H, d, $J=17.1\text{Hz}$)。

參考製造例 3

將 3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯胺 1.0g 溶解於 1,4-二噁烷 4mL，於此在室溫加入濃鹽酸 7mL。在同溫進行 20 分鐘攪拌後，將此溶液冷卻至 0°C ，滴入將亞硝酸鈉 184mg 溶解於水 4mL 的溶液。在同溫進行 15 分鐘攪拌後，於此反應液滴入將氯化錫(II) 1.11g 溶解於濃鹽酸 2mL 的溶液。於反應混合液加入 2N 氫氧化鈉並中和，將水層以乙酸乙酯萃取。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮，得到粗製物的 3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基聯胺 1.0g。

3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-

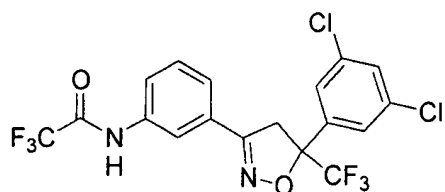
基]苯基聯胺



參考製造例 4

將在參考製造例 2 所製造之 3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯胺 3.0g 與三乙基胺 971mg 溶解於四氫呋喃 20mL，於此在 0℃滴入三氟乙酸酐 1.85g。在同溫進行 15 分鐘攪拌後，加入飽和碳酸氫鈉水溶液，並以乙酸乙酯萃取。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮後，得到 N-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}2,2,2-三氟乙酸鹽胺 3.84g。

N-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}2,2,2-三氟乙酸鹽胺

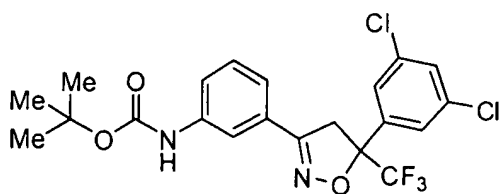


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 8.02(1H, br s), 7.94(1H, t, $J=1.8\text{Hz}$), 7.66-7.64(1H, m), 7.57-7.55(1H, m), 7.49-7.43(4H, m), 4.09(1H, d, $J=17.3\text{Hz}$), 3.71(1H, d, $J=17.3\text{Hz}$)。

參考製造例 5

將在參考製造例 4 所製造之 N-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}2,2,2-三氟乙酸醯胺 3.84g 與二碳酸二-第三丁基 8.21g 溶解於四氫呋喃 20 mL，於此在室溫加入 4-二甲基吡啶 195mg。在同溫進行 1.5 小時攪拌後，於反應混合物加入乙酸乙酯，將有機層以 2N 鹽酸，再以飽和碳酸氫鈉水溶液進行洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，將減壓下濃縮所得之殘渣溶解於甲醇 20mL，在室溫加入水 10mL、碳酸鈉 2.76g。在同溫進行 2 小時攪拌後，加入水並以乙酸乙酯萃取。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮後得到 {3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}胺基甲酸第三丁酯 3.5g。

{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}胺基甲酸第三丁酯

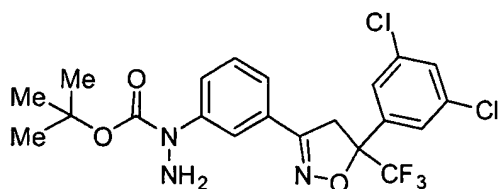


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 7.81(1H, s), 7.51(2H, s), 7.42-7.39(2H, m), 7.35-7.31(2H, m), 6.55(1H, br s), 4.11(1H, d, $J=16.9\text{Hz}$), 3.70(1H, d, $J=16.9\text{Hz}$), 1.53(9H, s)。

參考製造例 6

將在參考製造例 5 所製造之 {3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}胺基甲酸第三丁酯 3.50g 溶解於第三丁基甲基醚 22mL，28%氫氧化鈉水溶液 23mL、氨水 7mL、氯化銨 2.56g、三辛基甲基銨氯化物 100mg。於此混合液在室溫經 20 分鐘滴入 5%次亞氯酸鈉水溶液 53mL。在同溫進行 12 小時攪拌後將有機層分離，於水層加入第三丁基甲基醚並再度萃取。將合併的有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯 1.52g。

N-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯



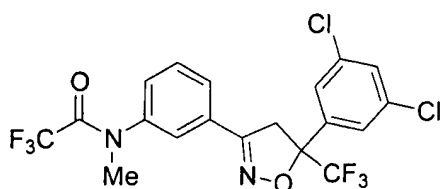
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 7.87(1H, s), 7.72-7.29(6H, m), 4.42(2H, br s), 4.09(1H, d, $J=17.2\text{Hz}$), 3.69(1H, d, $J=17.2\text{Hz}$), 1.53(9H, s)。

參考製造例 7

將在參考製造例 4 所製造之 N-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}2,2,2-三氟乙酸醯胺 3.71g 與碘化甲基 1.34g 溶解於 N,N-二甲基甲醯胺 20

mL，於此在室溫加入碳酸鈉 1.31g。在同溫進行 12 小時攪拌。於反應混合物以乙酸乙酯、2N 鹽酸及飽和碳酸氫鈉水溶液的順次洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮後，得到 N-甲基-N-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}2,2,2-三氟乙酸醯胺 3.70 g。

N-甲基-N-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}2,2,2-三氟乙酸醯胺

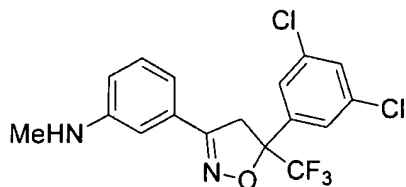


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 7.69-7.35(7H, m), 4.09(1H, d, $J=17.3\text{ Hz}$), 3.71(1H, d, $J=17.3\text{ Hz}$), 3.46-3.43(3H, m)。

參考製造例 8

將在參考製造例 7 所製造之 N-甲基-N-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}2,2,2-三氟乙酸醯胺 3.52g 溶解於甲醇 15mL，於此在室溫加入碳酸鈉 2.00g、水 5mL。在同溫進行 2 小時攪拌後，加入乙酸乙酯，將水層以乙酸乙酯萃取。將有機層以 2%鹽酸及飽和碳酸氫鈉水溶液的順次洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮後，得到 N-甲基-3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯胺 2.80g。

N-甲基-3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯胺

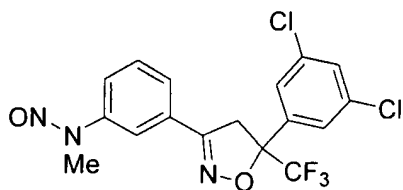


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 7.51(2H, d, $J=1.2\text{Hz}$), 7.41(1H, t, $J=1.8\text{Hz}$), 7.21(1H, t, $J=7.9\text{Hz}$), 6.95(1H, t, $J=2.0\text{Hz}$), 6.87(1H, ddd, $J=7.6, 1.5, 1.0\text{Hz}$), 6.69(1H, ddd, $J=8.3, 2.4, 0.7\text{Hz}$), 4.07(1H, d, $J=17.3\text{Hz}$), 3.85(1H, br s), 3.67(1H, d, $J=17.3\text{Hz}$), 2.86(3H, s)。

參考製造例 9

將在參考製造例 8 所製造之 N-甲基-3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯胺 2.6g 溶解於四氫呋喃 4ml，於此在室溫加入濃鹽酸 1.5mL、水 3.0mL。在室溫進行 15 分鐘攪拌後，於該混合液在 0℃滴入將亞硝酸鈉 581mg 溶解於水 5mL 的溶液。在同溫進行 1 小時攪拌後加入飽和碳酸氫鈉水溶液，將水層以乙酸乙酯萃取。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮後，得到 N-甲基-N-亞硝基-3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯胺 2.78g。

N-甲基-N-亞硝基-3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯胺

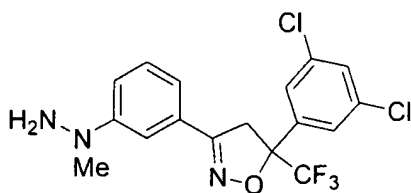


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 7.89-7.88(1H, m), 7.67-7.64(2H, m), 7.56-7.53(3H, m), 7.43-7.43(1H, m), 4.14(1H, d, $J=17.4\text{Hz}$), 3.76(1H, d, $J=17.4\text{Hz}$), 3.47(3H, s)。

參考製造例 10

於在參考製造例 9 所製造之 N-甲基-N-亞硝基-3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯胺 1.00g、乙醇 2mL、水 2mL 及乙酸 2mL 的混合物中，在室溫加入亞鉛 695mg。在室溫進行 5 小時攪拌後，將該混合液經過濾，於濾液加入無水碳酸氫鈉，以氯仿萃取。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到粗製物的 N-甲基-N-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}聯胺 1.1g。

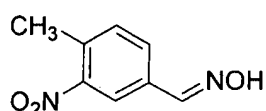
N-甲基-N-{3-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}聯胺



參考製造例 11

於 4-甲基-3-硝基苯甲醛 3.00g、羥基胺鹽酸鹽 1.64g、乙醇 30ml 及水 15ml 的混合物中室溫下加入乙酸鈉 2.24g，在室溫進行 1 小時攪拌。將反應混合物加入於水並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮後得到 5-羥基亞胺甲基-2-甲基硝基苯 2.77g。

5-羥基亞胺甲基-2-甲基硝基苯



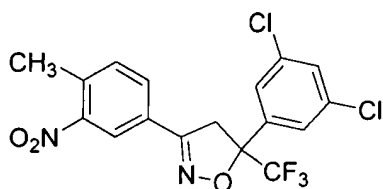
$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO}-d_6)\delta$: 11.53(1H, s), 8.24(1H, s), 8.17(1H, d, $J=1.7\text{Hz}$), 7.84(1H, dd, $J=8.0, 1.7\text{Hz}$), 7.54(1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 2.52(3H, s)。

參考製造例 12

將在參考製造例 11 所得之 5-羥基亞胺甲基-2-甲基硝基苯 2.77g 及 N-氯琥珀醯亞胺 2.06g 溶解於 30ml 的 N,N-二甲基甲醯胺，在 50℃ 進行 1 小時攪拌。於冷卻至室溫的反應液中加入 (3,5-二氯苯基)-3,3,3-三氟-1-丙烯 3.71g，再加入三乙基胺 1.56g，在室溫進行 6 小時攪拌。於反應混合物加入水，並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁

唑-3-基]-2-甲基硝基苯 4.99 g。

5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-甲基硝基苯



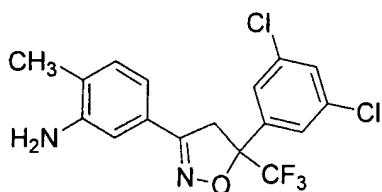
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 8.16(1H, d, $J=1.9\text{Hz}$), 7.90(1H, dd, $J=8.1, 1.9\text{Hz}$), 7.51(2H, d, $J=1.2\text{Hz}$), 7.45-7.43(2H, m), 4.11(1H, d, $J=17.1\text{Hz}$), 3.73(1H, d, $J=17.1\text{Hz}$), 2.66(3H, s)。

參考製造例 13

於 2.5%乙酸水溶液 19ml 加入鐵粉(10~20 篩子)1.89 g，於此在 75℃加入在參考製造例 12 所製造之 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-甲基硝基苯 4.62 g 的乙醇 29ml 懸浮液，在同溫進行 15 分鐘攪拌後，進一步在同溫下加入鐵粉 1.80 g，同溫下進行 1 小時攪拌。將冷卻至室溫的反應混合物經過濾，並以乙酸乙酯洗淨。於濾液加入飽和碳酸氫鈉水溶液與乙酸乙酯並萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-甲基苯胺 3.18 g。

5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-

基]-2-甲基苯胺

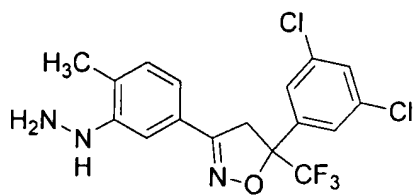


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 7.51(2H, d, $J=1.4\text{Hz}$), 7.41(1H, t, $J=1.8\text{Hz}$), 7.08(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.05(1H, d, $J=1.8\text{Hz}$), 6.88(1H, dd, $J=7.8, 1.7\text{Hz}$), 4.04(1H, d, $J=17.1\text{Hz}$), 3.71(2H, br s), 3.65(1H, d, $J=17.1\text{Hz}$), 2.19(3H, s)。

參考製造例 14

於在參考製造例 13 所製造之 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-甲基苯胺 420mg，在室溫加入濃鹽酸 2mL。在同溫進行 20 分鐘攪拌後，將該溶液冷卻至 0°C ，滴入將亞硝酸鈉 82mg 溶解於水 0.5mL 的溶液。在同溫進行 10 分鐘攪拌後，於該反應液中滴入將氯化錫(II)451mg 溶解於濃鹽酸 0.5mL 的溶液。其次於反應混合液加入飽和碳酸氫鈉水溶液並中和，將水層以乙酸乙酯萃取。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮，得到粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-甲基苯基聯胺 420mg。

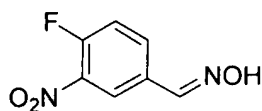
5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-甲基苯基聯胺



參考製造例 15

將 4-氟-3-硝基苯甲醛 2g、羥基胺鹽酸鹽 1.07g 及乙酸鈉 1.45g 溶解於乙醇 20ml 及水 10ml 的混合液，在室溫進行 6 小時攪拌。將反應混合物加於水並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，藉由減壓下濃縮後得到 2-氟-5-羥基亞胺甲基硝基苯 1.95g。

2-氟-5-羥基亞胺甲基硝基苯



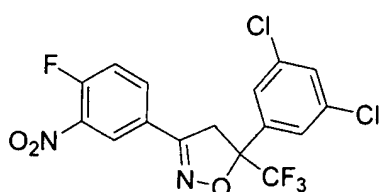
$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO}-\text{D}_6)\delta$: 11.63(1H, s), 8.34(1H, dd, $J=7.2$, 2.2Hz), 8.28(1H, s), 8.04-8.02(1H, m), 7.65-7.62(1H, m)。

參考製造例 16

將在參考製造例 15 所得之 2-氟-5-羥基亞胺甲基硝基苯 1.95g 及 N-氯琥珀醯亞胺 1.42g 溶解於二甲基甲醯胺 20ml，在 60℃ 進行 1 小時攪拌。於冷卻至室溫的反應混合液加入 2-(3,5-二氯苯基)-3,3,3-三氟-1-丙烯 2.55g，再加入三乙基胺 1.07g，在同溫進行 6 小時攪拌。於反應混合

物加入水，並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氟硝基苯 1.40 g。

5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氟硝基苯



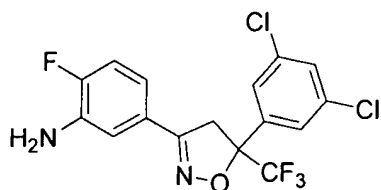
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 8.26(1H, dd, $J=6.9, 2.3\text{ Hz}$), 8.08-8.05(1H, m), 7.51(2H, d, $J=1.2\text{ Hz}$), 7.45(1H, t, $J=1.9\text{ Hz}$), 7.41(1H, dd, $J=10.1, 8.7\text{ Hz}$), 4.11(1H, d, $J=17.4\text{ Hz}$), 3.73(1H, d, $J=17.9\text{ Hz}$)。

參考製造例 17

將鐵粉 1.85 g 在室溫下加入於乙酸 0.2 g 及水 7 ml 的混合液，於此在 75℃加入在參考製造例 16 所得之 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氟硝基苯 1.40 g 的乙醇 15 ml 懸浮液，在 75℃進行 20 分鐘攪拌。過濾反應混合物，並將濾液在減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氟硝基苯胺 806 mg。

5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-

基]-2-氟硝基苯胺

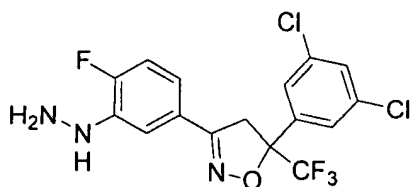


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 7.50(2H, d, $J=1.4\text{Hz}$), 7.42(1H, t, $J=1.8\text{Hz}$), 7.18(1H, dd, $J=8.5, 2.2\text{Hz}$), 7.01(1H, dd, $J=10.6, 8.5\text{Hz}$), 6.90-6.87(1H, m), 4.03(1H, d, $J=17.0\text{Hz}$), 3.85(2H, br s), 3.64(1H, d, $J=17.0\text{Hz}$)。

參考製造例 18

將在參考製造例 17 所製造之 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氟硝基苯胺 500mg 溶解於 1,4-二噁烷 2mL，於此在室溫加入濃鹽酸 4mL。在同溫進行 20 分鐘攪拌後，將該溶液冷卻至 0°C ，滴入將亞硝酸鈉 96mg 溶解於水 5mL 的溶液。在同溫進行 15 分鐘攪拌後，於該反應液滴入將氯化錫(II)528mg 溶解於濃鹽酸 1mL 的溶液。其次，於反應混合液加入 2N 氫氧化鈉並中和後，將水層以乙酸乙酯萃取。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮，得到粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氟苯基聯胺 412mg。

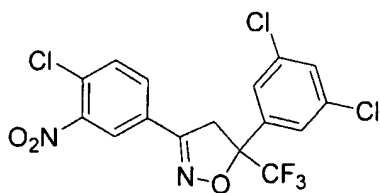
5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氟苯基聯胺



參考製造例 19

將 2-氯-5-羥基亞胺甲基硝基苯 2.92g 及 N-氯琥珀醯亞胺 1.94g 溶解於二甲基甲醯胺 30ml，在 60℃ 進行 1 小時攪拌。於冷卻至室溫的混合液中加入 2-(3,5-二氯苯基)-3,3,3-三氟-1-丙烯 3.50g，再加入三乙基胺 1.46g，並進行 6 小時攪拌。於反應混合物加入水，並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯硝基苯 4.42g。

5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯硝基苯

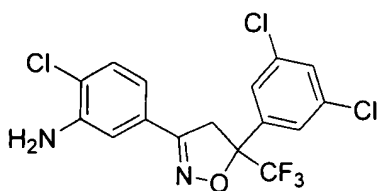


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 8.09(1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 7.89(1H, dd, $J=8.5, 2.1\text{Hz}$), 7.65(1H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 7.50(2H, d, $J=1.6\text{Hz}$), 7.45(1H, t, $J=1.6\text{Hz}$), 4.09(1H, d, $J=17.3\text{Hz}$), 3.71(1H, d, $J=17.3\text{Hz}$)。

參考製造例 20

將鐵粉 3.46g 在室溫下加入於乙酸 0.38g、水 15ml 及乙醇 30ml 的混合液，於此在 75℃加入在參考製造例 19 所得之 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯硝基苯 2.73g，在 75℃進行 50 分鐘攪拌。過濾反應混合物，將濾液在減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯胺 1.65g。

5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯胺



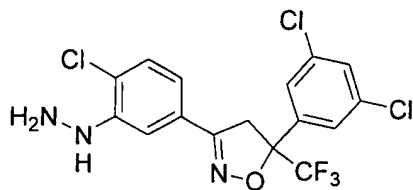
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 7.49(2H, d, $J=1.7\text{Hz}$), 7.42(1H, t, $J=1.7\text{Hz}$), 7.29(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.13(1H, d, $J=2.0\text{Hz}$), 6.89(1H, dd, $J=8.4, 2.0\text{Hz}$), 4.18(2H, br s), 4.03(1H, d, $J=17.1\text{Hz}$), 3.64(1H, d, $J=16.4\text{Hz}$)。

參考製造例 21

將在參考製造例 20 所製造之 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯胺 500mg 溶解於 1,4-二噁烷 2mL，在室溫加入濃鹽酸 6mL。在同溫進行 20 分鐘攪拌後，將該溶液冷卻至 0℃，滴入將亞硝酸鈉 93mg

溶解於水 3mL 的溶液。在同溫進行 15 分鐘攪拌後，於該反應液中滴入將氯化錫(II)507mg 溶解於濃鹽酸 4mL 的溶液。其次於反應混合液加入 2N 氫氧化鈉，經中和後將水層以第三丁基甲基醚萃取。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮，得到粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺 510mg。

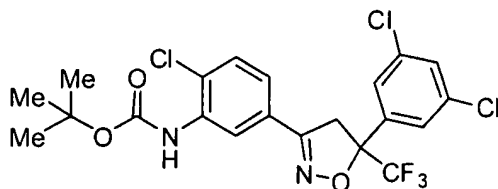
5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯基聯胺



參考製造例 22

將三光氣 6.3g 溶解於甲苯 50mL，於此在室溫滴入將在參考製造例 20 所得之 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯胺 8.7g 溶解於甲苯 50mL 及四氫呋喃 10mL 的溶液。於反應溶液追加甲苯 50mL，在 80℃ 進行 1 小時攪拌。冷卻至室溫後，將反應混合物在減壓下進行濃縮，加入第三丁醇 100mL。於該溶液在室溫滴入三乙基胺 14.6g，在同溫進行 16 小時攪拌。於反應混合物加入飽和碳酸氫鈉水溶液，以氯仿萃取。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 {2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}胺基甲酸第三丁酯 9.81g。

{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}胺基甲酸第三丁酯



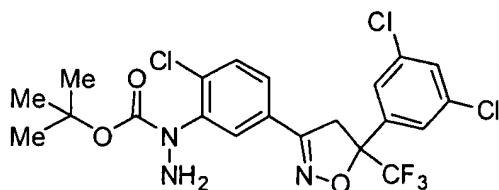
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 8.39(1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 7.52(2H, d, $J=1.8\text{Hz}$), 7.47(1H, dd, $J=8.5, 2.1\text{Hz}$), 7.42(1H, t, $J=1.8\text{Hz}$), 7.39(1H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 7.09(1H, br s), 4.11(1H, d, $J=17.3\text{Hz}$), 3.70(1H, d, $J=17.3\text{Hz}$), 1.55(9H, s)。

參考製造例 23

將氫化鈉(60%油性)760mg 懸浮於四氫呋喃 200mL，於此在室溫滴入在參考製造例 22 所製造之{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}胺基甲酸第三丁酯 8.80g 的四氫呋喃 50mL 溶液。在同溫進行 20 分鐘攪拌後，在室溫加入 O-(二苯基磷醯基)羥基胺 6.0g。在同溫進行 15 小時攪拌後，加入水與乙酸乙酯，將水層以乙酸乙酯萃取。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}胺基甲酸第三丁酯 6.58g。

N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異

噁唑-3-基]苯基}肼基甲酸第三丁酯

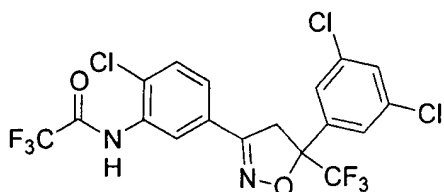


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 7.55-7.44(6H, m), 4.07(1H, d, $J=17.1\text{Hz}$), 3.68(1H, d, $J=17.1\text{Hz}$), 1.41(9H, br s)。

參考製造例 24

將在參考製造例 20 所得之{5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-氯苯胺 3.04g 及三乙基胺 772mg 溶解於四氫呋喃 20mL，於此在 0℃滴入三氟乙酸酐 1.47g。在同溫進行 30 分鐘攪拌後，將反應混合物以第三丁基甲基醚稀釋。於反應混合物加入乙酸乙酯，將有機層以 2N 鹽酸及飽和碳酸氫鈉水溶液的順序洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮後得到 N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}2,2,2-三氟乙醯胺 3.63g。

N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}2,2,2-三氟乙醯胺

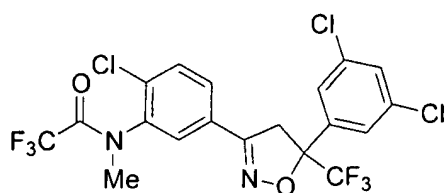


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 8.53(1H, d, $J=2.2\text{Hz}$), 8.48(1H, br s), 7.67(1H, dd, $J=8.5, 2.0\text{Hz}$), 7.52(1H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 7.50(2H, s), 7.43-7.42(1H, m), 4.09(1H, d, $J=17.3\text{Hz}$), 3.71(1H, d, $J=17.3\text{Hz}$)。

參考製造例 25

將氫化鈉(60%油性)懸浮於 N,N -二甲基甲醯胺 15mL, 於此在室溫滴入將參考製造例 24 所得之 $\{N-\{2\text{-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}\}-2,2,2\text{-三氟乙醯胺} 3.6\text{g}$ 溶解於 N,N -二甲基甲醯胺 15mL 的溶液。在同溫進行 20 分鐘攪拌後, 加入碘化甲基 1.52g, 再進行 1 小時攪拌。於反應混合液加入 2N 鹽酸, 以第三丁基甲基醚進行萃取。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後, 減壓下濃縮後, 得到 $N\text{-甲基-}N-\{2\text{-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}\}-2,2,2\text{-三氟乙醯胺} 3.73\text{g}$ 。

$N\text{-甲基-}N-\{2\text{-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}\}-2,2,2\text{-三氟乙醯胺}$



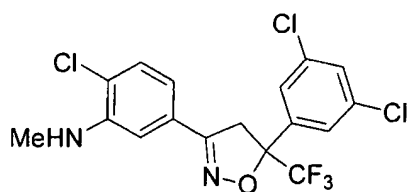
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 7.70-7.40(6H, m), 4.06(1H, dd,

$J=17.2$, 13.0Hz) , $3.73\text{-}3.64(1\text{H}$, m) , $3.33\text{-}3.32(3\text{H}$, m)
。

參考製造例 26

將在參考製造例 25 所得之 N-甲基-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}2,2,2-三氟乙醯胺 3.6g 溶解於甲醇 20mL，於此在室溫加入碳酸鉀 1.97g，在同溫進行 3 小時攪拌。過濾沈澱物，於濾液加入水，以第三丁基甲基醚進行萃取。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮後，得到 N-甲基-2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯胺 2.20g。

N-甲基-2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯胺

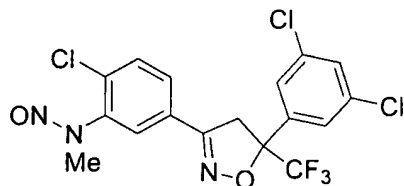


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: $7.51(2\text{H}$, d , $J=1.8\text{Hz}$) , $7.42(1\text{H}$, t , $J=1.8\text{Hz}$) , $7.28(1\text{H}$, d , $J=8.0\text{Hz}$) , $6.99(1\text{H}$, d , $J=2.0\text{Hz}$) , $6.78(1\text{H}$, dd , $J=8.0$, 2.0Hz) , $4.48(1\text{H}$, d , $J=5.1\text{Hz}$) , $4.07(1\text{H}$, d , $J=17.2\text{Hz}$) , $3.67(1\text{H}$, d , $J=17.2\text{Hz}$) , $2.94(3\text{H}$, d , $J=5.1\text{Hz}$) 。

參考製造例 27

將在參考製造例 26 所製造之 N-甲基-2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯胺 2.55 g 溶解於四氫呋喃 4ml，加入濃鹽酸 4.5mL，其次加入水 5.0mL。在室溫進行 10 分鐘攪拌後，將該混合液冷卻至 0℃，滴入將亞硝酸鈉 539mg 溶解於水 5mL 的溶液。在同溫進行 1 小時攪拌後，加入飽和碳酸氫鈉水溶液並中和後，以乙酸乙酯萃取。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮後，得到 N-甲基-N-亞硝基-2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯胺 2.69 g。

N-甲基-N-亞硝基-2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯胺



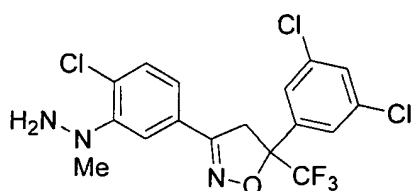
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 7.84-7.31(6H, m), 4.09(1H, d, $J=17.3\text{ Hz}$), 3.71(1H, d, $J=17.3\text{ Hz}$), 3.41(3H, s)。

參考製造例 28

將在參考製造例 27 所製造之 N-甲基-N-亞硝基-2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯胺 2.61 g 溶解於四氫呋喃 4ml，於此在室溫加入乙醇 8mL、水 8mL、乙酸 8mL，於該混合物在室溫加入亞鉛 695mg。在室溫進行 3 小時攪拌後，將該混合液經過濾，

於濾液中加入無水碳酸氫鈉，以乙酸乙酯進行萃取。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 N-甲基-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}聯胺 764 mg。

N-甲基-N-{2-氯-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]苯基}聯胺



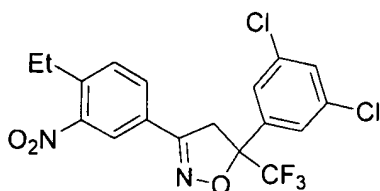
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 7.68-7.67(1H, m), 7.51(2H, s), 7.42-7.40(2H, m), 7.23-7.20(1H, m), 4.08(1H, d, $J=17.2\text{Hz}$), 3.85(2H, br s), 3.69(1H, d, $J=17.2\text{Hz}$), 3.06(3H, s)。

參考製造例 29

將 2-乙基-5-羥基亞胺甲基硝基苯 4.30g 及 N-氯琥珀醯亞胺 2.97g 溶解於二甲基甲醯胺 40ml，在 60°C 進行 1 小時攪拌。於冷卻至室溫的反應液中，加入 2-(3,5-二氯苯基)-3,3,3-三氟-1-丙烯 3.5g，再加入三乙基胺 1.7g，並進行 6 小時攪拌。於反應混合物加入水，並以乙酸乙酯萃取，將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三

氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-乙基硝基苯 5.74 g。

5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-乙基硝基苯

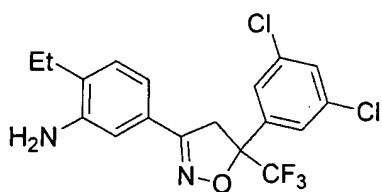


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 8.07(1H, d, $J=1.9\text{Hz}$), 7.91(1H, dd, $J=8.0, 1.9\text{Hz}$), 7.51(2H, d, $J=1.6\text{Hz}$), 7.46(1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.44(1H, t, $J=1.6\text{Hz}$), 4.10(1H, d, $J=17.3\text{Hz}$), 3.72(1H, d, $J=17.3\text{Hz}$), 2.96(2H, q, $J=7.5\text{Hz}$), 1.30(3H, t, $J=7.5\text{Hz}$)。

參考製造例 30

將鐵粉 4.33 g 在室溫下加入於乙酸 0.5 ml、水 22 ml 及乙醇 34 ml 的混合液，於此在 75℃ 加入在參考製造例 29 所得之 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-乙基硝基苯 5.60 g，在同溫進行 3 小時攪拌。過濾冷卻至室溫的反應混合物，以乙酸乙酯洗淨。於濾液加入飽和碳酸氫鈉水溶液，以乙酸乙酯進行萃取。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，藉由減壓下濃縮得到 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-乙基苯胺 5.20 g。

5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-乙基苯胺

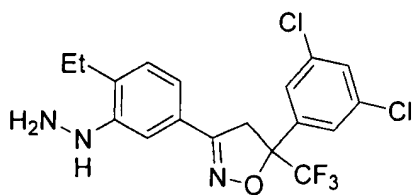


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 7.51(2H, d, $J=1.7\text{Hz}$), 7.41(1H, t, $J=1.7\text{Hz}$), 7.10(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.04(1H, d, $J=1.7\text{Hz}$), 6.93(1H, dd, $J=7.8, 1.7\text{Hz}$), 4.05(1H, d, $J=17.1\text{Hz}$), 3.74(2H, br s), 3.65(1H, d, $J=17.1\text{Hz}$), 2.52(2H, q, $J=7.5\text{Hz}$), 1.25(3H, t, $J=7.5\text{Hz}$)。

參考製造例 31

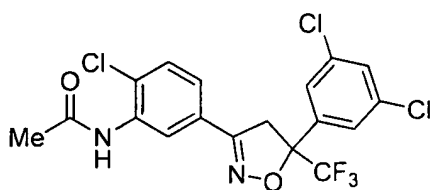
將在參考製造例 30 所製造之 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-乙基苯胺 1.00g 溶解於 1,4-二噁烷 2mL，於此在室溫加入濃鹽酸 4mL。在同溫進行 20 分鐘攪拌後，將該溶液冷卻至 0°C ，滴入將亞硝酸鈉 188mg 溶解於水 1mL 的溶液。在同溫進行 15 分鐘攪拌後，於該反應液滴入將氯化錫(II)1.03g 溶解於濃鹽酸 2mL 的溶液。於反應混合液加入 2N 氫氧化鈉並中和，將水層以氯仿萃取。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮，得到粗製物的 5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-乙基苯基聯胺 1.31g。

5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異噁唑-3-基]-2-乙基苯基聯胺



參考製造例 32

將在參考製造例 20 所得之化合物 2.0 g 溶解於乙酸酐 10 mL，在室溫進行 0.5 小時攪拌。將反應混合物在減壓下進行濃縮，將濃縮物溶解於乙酸乙酯，以飽和碳酸氫鈉水溶液，其次以飽和食鹽水進行洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮，得到粗製物的下述式所示化合物 3.0 g。



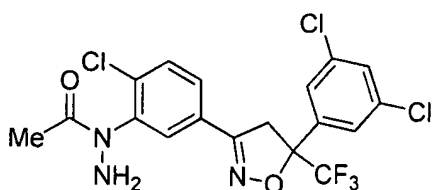
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 8.59(1H, br s), 7.67(1H, br s), 7.57(1H, dd, $J=8.4, 2.1\text{ Hz}$), 7.50(2H, d, $J=1.2\text{ Hz}$), 7.43-7.42(2H, m), 4.09(1H, d, $J=17.4\text{ Hz}$), 3.70(1H, d, $J=17.4\text{ Hz}$), 2.28(3H, s)。

參考製造例 33

將在參考製造例 32 所得之化合物 2.2 g 溶解於第三丁基甲基醚 30 mL，加入 28%氫氧化鈉水溶液 14 mL、氨水 4.5 mL、氯化銨 1.56 g、三辛基甲基銨氯化物 274 mg。於該

混合液在室溫經 20 分鐘滴入 5%次亞氯酸鈉水溶液 32 mL。

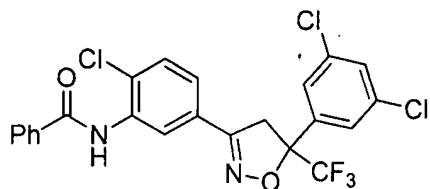
在同溫進行 2 小時攪拌後，分離有機層，於水層加入第三丁基甲基醚並萃取。將合併的有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到下述式所示化合物 2.0 g。



熔點：92℃

參考製造例 34

將在參考製造例 20 所得之化合物 2.0 g 溶解於吡啶 5 mL，在室溫加入苯甲醯基氯化物 1.4 g。在同溫進行 0.5 小時攪拌後，於反應混合物加入乙酸乙酯，並以 3%鹽酸洗淨。將有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下濃縮，得到粗製物的下述式所示化合物 2.4 g。

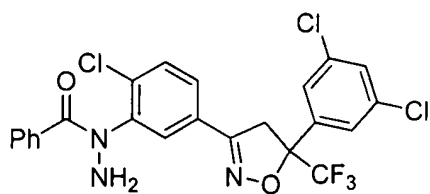


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 8.80(1H, d), 8.53(1H, br s), 7.94-7.92(2H, m), 7.65-7.62(2H, m), 7.58-7.48(5H, m),

7.43(1H, t), 4.16(1H, d), 3.77(1H, d)。

參考製造例 35

將在參考製造例 34 所得之化合物 2.4g 溶解於四氫呋喃 20mL，加入 28%氫氧化鈉水溶液 14mL、氨水 4.5mL、氯化銨 2.56g、三辛基甲基銨氯化物 274mg。於該混合液在室溫經 1 小時滴入 5%次亞氯酸鈉水溶液 48mL。在同溫進行 2 小時攪拌後，分離有機層，於水層加入第三丁基甲基醚並萃取。將合併的有機層以無水硫酸鈉乾燥後，減壓下使其濃縮。將所得之殘渣藉由矽膠管柱層析，得到下述式所示化合物 1.8g。



熔點：87℃

其次，說明本發明的防除有害生物之組成物的製劑例。且份表示重量份。

製劑例 1

將選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯肼化合物 2 份、以及百利普芬 7 份溶解於二甲苯 37.5 份及 N,N-二甲基甲醯胺 37.5 份，於此加入聚環氧乙烷苯乙烯苯基醚 10 份及十二烷基苯磺酸鈣 6 份，仔細攪拌混合後得到乳劑。

製劑例 2

將選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯肼化合物 5 份、以及百利普芬 4 份溶解於二甲苯 37.5 份及 N,N-二甲基甲醯胺 37.5 份，於此加入聚環氧乙烷苯乙烯苯基醚 10 份及十二烷基苯磺酸鈣 6 份，仔細攪拌混合後得到乳劑。

製劑例 3

於選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群之 1 種醯肼化合物 20 份、以及百利普芬 20 份的混合物中，加入 Solpor 5060(東邦化學註冊商標名)5 份，充分混合後加入 Carplex#80(鹽野義製藥註冊商標名，合成含氫氧化矽微粉末)32 份，加入 300 篩子矽藻土 23 份，以果汁機混合後得到水合劑。

製劑例 4

加入選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯肼化合物 1 份、百利普芬 2 份、合成含氫氧化矽微粉末 5 份、十二烷基苯磺酸鈉 5 份、膨潤土 30 份及黏土 57 份，仔細攪拌混合後加入適合於彼等混合物的當量水，進一步攪拌後以增粒機進行製粒，經通風乾燥後得到粒劑。

製劑例 5

將選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯肼化合物 1.5 份、百利普芬 3 份、合成含氫氧化矽微粉末 1 份、作為凝集劑的 DoloresB(三共公司製)1 份、黏土 7 份在乳鉢中充分混合後，以果汁機進行攪拌混合。於所得之混合物中加入磁土(cut clay)86.5 份，經充分攪拌混合後得到粉劑。

製劑例 6

混合選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯肼化合物 5 份；百利普芬 5 份；含有聚環氧乙烷烷基醚硫酸酯銨鹽 50 份的白碳(white carbon)35 份；以及水 55 份，以濕式粉碎法進行微粉碎後得到製劑。

製劑例 7

將選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯肼化合物 0.2 份、以及百利普芬 0.3 份的混合物溶解於二氯甲烷 10 份，將此混合於 Isopar M(異鏈烷烴：外顯子化學註冊商標名)89.5 份中後得到油劑。

製劑例 8

將選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯肼化合物 0.05 份、百利普芬 0.05 份、以及新噻唑(中央化成股份有限公司)49.9 份放入氣膠罐，附上氣膠配管後，填充 25 份的二甲基醚及 25 份的 LPG，裝上執行器後得到油性氣

膠。

製劑例 9

將混合溶解選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯肼化合物 0.2 份、百利普芬 0.4 份、BHT0.01 份、二甲苯 5 份、脫溴灯油 3.39 份、以及乳化劑{Atmos300(Atmos chemical 公司註冊商標名)}1 份者與蒸餾水 50 份填充於氣膠容器，附上配管部分後通過該配管加壓填充噴射劑(LPG)40 份後得到水性氣膠。

製劑例 10

將選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯肼化合物 2 份、以及百利普芬 3 份溶解於二乙二醇單乙基醚 80 份，於此混合碳酸丙烯酯 15 份後得到 SPOT-ON 液劑。

製劑例 11

將選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯肼化合物 5 份、以及百利普芬 5 份溶解於二乙二醇單乙基醚 70 份，於此混合 2-辛基十二碳醇 20 份後得到 POUR-ON 液劑。

製劑例 12

於選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯肼化合物 0.25 份、以及百利普芬 0.25 份的混合物中，添加 Nikkor

TEALS-42(日光化學·月桂基硫酸三乙醇胺之 42%水溶液)
60 份、丙二醇 20 份，充分攪拌混合至成為均勻溶液後，
加入水 19.5 份，進一步充分攪拌混合，得到均勻溶液的
洗劑。

製劑例 13

完全混合選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯
肼化合物 80mg、百利普芬 20mg、乳糖 68.75mg、玉米澱
粉 237.5mg、微結晶性纖維素 43.75mg、聚乙烯基吡咯烷
酮 18.75mg、鈉羧基甲基澱粉 28.75mg、以及硬脂酸鎂 2.5
mg，將混合物經壓縮後得到適切尺寸的錠劑。

製劑例 14

完全混合選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯
肼化合物 100mg、百利普芬 100mg、乳糖 148mg、以及硬
脂酸鎂 2mg，填充於硬殼明膠膠囊，或羥基丙基甲基纖維
素膠囊後得到膠囊劑。

製劑例 15

將選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯肼化
合物 2.5 份、百利普芬 2.5 份溶解於聚山梨酯 85 5 份、苯甲
醇 3 份、丙二醇 30 份，使用磷酸鹽緩衝液調整至 pH6.0~
6.5 後，以水補充至最終容量後得到經口投與用液劑。

製劑例 16

將選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯肼化合物 3.6 份、百利普芬 3.6 份、以及 V o s c o S-55(丸石製藥股份有限公司製)92.8 份在 100℃下使其溶解混合後注入於塞劑形，經冷卻固化後得到塞劑。

製劑例 17

將選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯肼化合物 0.05g、以及百利普芬 0.05g 的混合物，溶解於丙二醇 2 ml，含浸於 4.0×4.0cm、厚度 1.2cm 的多孔陶瓷板，得到加熱式燻煙劑。

製劑例 18

將選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯肼化合物 2.5 份、百利普芬 2.5 份、乙烯-甲基丙烯酸甲酯共聚物(共聚物中之甲基丙烯酸甲酯的比率：10 重量%的 ACRYFTWD301，住友化學製)95 份在密閉式加壓捏合器(森山製作所製)熔融混煉，將所得之混煉物自押出成型機介著成型模具押出，得到長度 15cm，直徑 3mm 的棒狀成型體。

製劑例 19

將選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯肼化合物 2.5 份與百利普芬 2.5 份與軟質鹽化乙烷基樹脂 95 份在密閉式加壓捏合器(森山製作所製)進行熔融混煉，將所得

之混煉物自押出成型機介著成型模具進行押出，得到長度 15cm、直徑 3mm 的棒狀成型體。

製劑例 20

混合含有選自本醯肼化合物(1)~(63)所成群的 1 種醯肼化合物 10 份、百利普芬 10 份、聚環氧乙烷烷基醚硫酸酯銨鹽 50 份的白碳 35 份及水 55 份，以濕式粉碎法進行微粉碎後得到製劑。

其次，說明有關本發明的防除有害生物之組成物對於有害生物具有優良防除效力之試驗例。

試驗例 1

將製劑例 16 所得之本醯肼化合物及百利普芬的製劑以水稀釋至如表 1 所示的有效成分濃度，調製出試驗用藥液。

將上述試驗用藥液 0.7ml 加入於離子交換水 100ml。於該液中放入淡色庫蚊(*Culex pipiens pallens*)終令幼蟲 20 頭，8 天後對該生死進行調查而求得死蟲率。

結果如下述表 1 所示。

[表 1]

本醯肼化合物+百利普芬	濃度(ppm w/v)	死蟲率(%)
本醯肼化合物(11)+百利普芬	500+500	100
本醯肼化合物(13)+百利普芬	500+500	100
本醯肼化合物(17)+百利普芬	500+500	100
本醯肼化合物(30)+百利普芬	500+500	100
本醯肼化合物(31)+百利普芬	500+500	100
本醯肼化合物(38)+百利普芬	500+500	100

該結果表示本發明的防除有害生物之組成物顯示高防除效果。

試驗例 2

將跳蚤飼育用培養基(混合至海砂/粉末飼料/乾燥酵母/乾燥牛血=80/16/3/1 重量%者)各 6g 放入微量瓶中。對於本醯肼化合物及百利普芬，在跳蚤飼育用培養基中進行處理時，以丙酮溶液調整至如表 2 所示濃度(對於培養基之重量%)。將該丙酮溶液 1.0ml 於培養基進行處理，攪拌至均勻後使其風乾。於直徑 3.8cm 鋁皿上載上濾紙(TOYO No.2；直徑 3.8cm)，使用適度濕度的筆，將跳蚤卵 20 個放置於該濾紙上。將風乾後經藥劑處理後的培養基 1.0g 均勻撒在放有卵的濾紙上，將鋁皿收在樹脂盤內後，在溫度 26℃，濕度 85~95%下保管。對僅以丙酮做處理的培養基亦進行相同方法，作為無處理區。約 3 週後觀察其貓蚤的羽化，藉由以下計算式算出羽化阻礙率。

$$\text{補正羽化阻礙率} = (C - T) \div C \times 100$$

C：藥劑無處理區的羽化率

T：藥劑處理區的羽化率

結果如下述表 2 所示。

[表 2]

本醯肼化合物		百利普芬	羽化阻礙率(%)
化合物	濃度(%)	濃度(%)	
-	-	10^{-8}	4.0
(17)	0.4×10^{-4}	-	6.3
(17)	0.4×10^{-4}	10^{-8}	63
(31)	0.4×10^{-4}	-	34
(31)	0.4×10^{-4}	10^{-8}	86

其結果表示本發明的防除有害生物之組成物顯示高羽化阻礙活性。

產業上可利用性

本發明的防除有害生物之組成物對於有害生物具有優良防除效力故為有用。

發明專利說明書

(本申請書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：100127409

A01N43/80 (2006.01)

※申請日：100 年 08 月 02 日

※IPC 分類：A01N43/40 (2006.01)

一、發明名稱：(中文／英文)

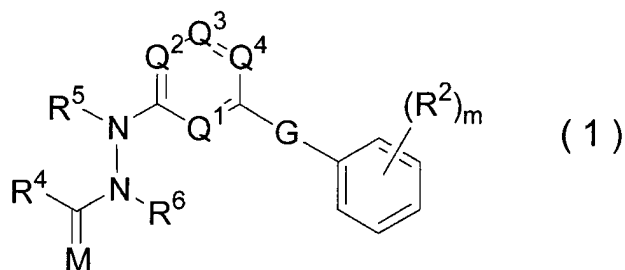
防除有害生物之組成物

Pest control composition

二、中文發明摘要：

本發明提供一種對於有害生物具有優良防除效力的組成物。

本發明係為含有如下述式(1)所示醯肼化合物[式中，G、M、Q¹、Q²、Q³、Q⁴、R²、R⁴、R⁵、R⁶及m表示如說明書所記載的意思]、與百利普芬(Pyriproxyfen)的防除有害生物之組成物；以及將下述式(1)所示醯肼化合物、與百利普芬之有效量施用於有害生物或有害生物的生息場所的有害生物防除方法。

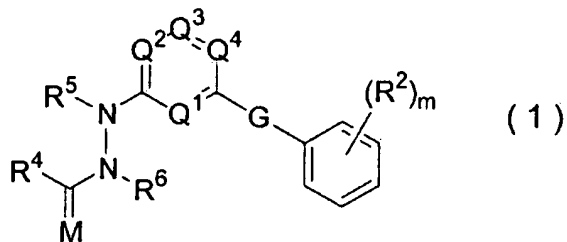


三、英文發明摘要：

A composition having an excellent control activity on pests is provided.

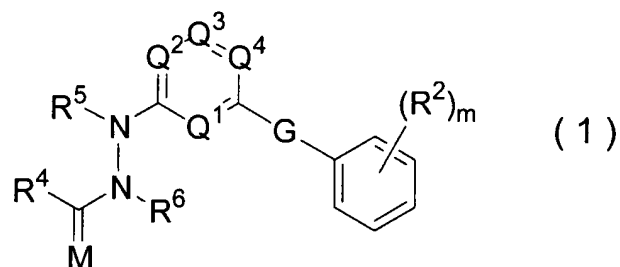
[Means of Achievement]

A pest control composition comprising (i) a hydrazide compound shown by the following formula (1) [wherein G, M, Q¹, Q², Q³, Q⁴, R², R⁴, R⁵, R⁶, and m have the meanings listed in the specification, and (ii) pyriproxyfen. A pest control method comprising a step of applying effective amounts of (i) a hydrazide compound shown by the following formula (1) and (ii) pyriproxyfen to pests or pest habitats.



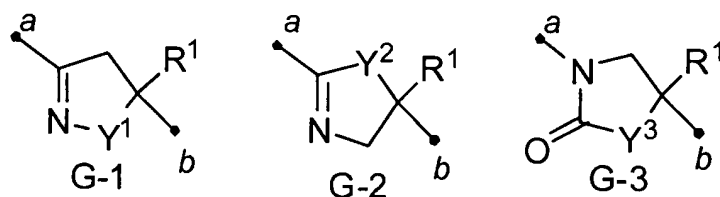
七、申請專利範圍：

1. 一種防除有害生物之組成物，其特徵為含有式 (1)



[式中，

G 表示下述式 G-1 ~ G-3 中任一所示基



(且，點 a 及點 b 表示結合鍵，點 b 表示與苯基環之結合鍵)，

R¹ 表示 C1-C4 鹵化烷基，

Y¹ 表示氧原子、硫原子或 NR⁷ 基，

Y² 表示氧原子、硫原子、NR⁷ 基或伸甲基，

Y³ 表示氧原子、硫原子、NR⁷ 基或伸甲基，

R⁷ 表示 C1-C6 烷基、C2-C6 烯基、C2-C6 炔基、C3-C6 環烷基、C4-C7 環烷基烷基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C2-C6 烷基胺基羰基、C3-C9 二烷基胺基羰基、

苯基、氰基、甲醯基或氫原子，

M 表示氧原子或硫原子，

Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 表示相同或相異之氮原子或 CR^3 基，

R^3 表示可由鹵素原子所取代之 C1-C6 烷基，可由鹵素原子所取代之 C1-C6 烷氧基、硝基、氰基、鹵素原子或氫原子，

m 表示 0 至 5 的整數中任一，

R^2 表示可由鹵素原子所取代之 C1-C6 烷基，可由鹵素原子所取代之 C1-C6 烷氧基、C1-C6 烷基硫基、C1-C6 烷基亞磺醯基、C1-C6 烷基磺醯基、硝基、氰基或鹵素原子(但，m 為 2~5 之整數中任一時，各 R^2 為相同或相異)，

R^5 及 R^6 為相同或相異，可由選自群 E1 的基所取代之 C1-C12 鏈式烴基、可由選自群 E2 的基所取代之苯甲醯基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C3-C12 環烷基、甲醯基或氫原子，

R^4 表示可由選自群 E1 的基所取代之 C1-C12 鏈式烴基、可由選自群 E2 的基所取代之 C3-C12 環式烴基、可由選自群 E2 的基所取代之 5~6 員雜環基、 OR^8 基、 $N(R^9)R^{10}$ 基或氫原子，

R^8 表示可由選自群 E1 的基所取代之 C1-C12 鏈式烴基、可由選自群 E2 的基所取代之 C3-C12 環式烴基或可由選自群 E2 的基所取代之 5~6 員雜環基，

R^9 表示可由選自群 E1 的基所取代之 C1-C12 鏈式烴基或可由選自群 E2 的基所取代之 C3-C12 環式烴基，

R^{10} 表示可由選自群 E1 的基所取代之 C1-C12 鏈式烴基或氫原子，或 R^9 與 R^{10} 表示以末端結合的 C2-C9 烷烴二基，

群 E1 表示可由選自群 E2 的基所取代之 C3-C12 環式烴基、可由選自群 E2 的基所取代之 5~6 員雜環基、可由選自群 E2 的基所取代之苯氧基、可由選自群 E2 的基所取代之苯基胺基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C1-C6 烷氧基、C1-C6 烷基胺基、C2-C12 二烷基胺基、硝基、氰基、甲醯基及鹵素原子所成群，

群 E2 表示可由鹵素原子所取代之 C1-C6 烷基，可由鹵素原子所取代之 C1-C6 烷氧基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C1-C6 烷基胺基、C2-C12 二烷基胺基、硝基、氰基、甲醯基及鹵素原子所成群]所示醯肼化合物、與百利普芬(Pyriproxyfen)。

2.如申請專利範圍第 1 項之防除有害生物之組成物，其中式(1)中，G 為 G-1 所示基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為上述定義的基，m 為 2， $(R^2)_m$ 為 3 位及 5 位之取代基， R^2 為氯原子。

3.如申請專利範圍第 1 項或第 2 項之防除有害生物之組成物，其中式(1)中， R^6 為氫原子。

4.如申請專利範圍第 1 項至第 3 項中任一項的防除有害生物之組成物，其中式(1)中， R^5 為氫原子或甲基。

5.如申請專利範圍第 1 項至第 4 項中任一項的防除有

害生物之組成物，其中式(1)中， R^3 為鹵素原子。

6.如申請專利範圍第1項至第5項中任一項的防除有害生物之組成物，其中式(1)中， R^3 為氮原子。

7.如申請專利範圍第1項至第6項中任一項的防除有害生物之組成物，其中式(1)中， R^4 為C2-C6烷基、C1-C6鹵化烷基、C3-C6環烷基或(C1-C6烷氧基)C1-C6烷基。

8.如申請專利範圍第1項至第7項中任一項的防除有害生物之組成物，其中式(1)中， R^4 為C2-C6烷基。

9.如申請專利範圍第1項至第7項中任一項的防除有害生物之組成物，其中式(1)中， R^4 為C1-C6鹵化烷基。

10.如申請專利範圍第1項至第7項中任一項的防除有害生物之組成物，其中式(1)中， R^4 為C3-C6環烷基。

11.如申請專利範圍第1項至第7項中任一項的防除有害生物之組成物，其中式(1)中， R^4 為(C1-C6烷氧基)C1-C6烷基。

12.一種有害生物的防除方法，其特徵為將申請專利範圍第1項之式(1)所示醯肼化合物與百利普芬(Pyriproxyfen)的有效量施用於有害生物或有害生物的生息場所。

13.一種使用，其特徵為欲防除有害生物而組合申請專利範圍第1項之式(1)所示醯肼化合物與百利普芬(Pyriproxyfen)的使用。

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：無

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

