



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公告本

(11)證書號數：TW I600651 B

(45)公告日：中華民國 106 (2017) 年 10 月 01 日

(21)申請案號：101114261

(22)申請日：中華民國 101 (2012) 年 04 月 20 日

(51)Int. Cl.：

C07D401/12 (2006.01)

C07D403/12 (2006.01)

A01N43/56 (2006.01)

A01N43/58 (2006.01)

A01P17/00 (2006.01)

A01C1/08 (2006.01)

A01P7/00 (2006.01)

(30)優先權：2011/04/21

美國

61/477,620

(71)申請人：巴地斯顏料化工廠(德國) BASF SE (DE)

德國

(72)發明人：迪費伯 克里斯堤恩 DEFIEBER, CHRISTIAN (DE)；索吉爾 薩巴斯添 SORGEL, SEBASTIAN (DE)；沙玲格 丹尼爾 SALINGER, DANIEL (DE)；樂 費駱伊 羅南 LE VEZOUET, RONAN (FR)；庫伯 卡斯登 KORBER, KARSTEN (DE)；葛洛伯 史帝芬 GROB, STEFFEN (DE)；考伯特森 黛博拉 L CULBERTSON, DEBORAH L. (US)；郡島浩志 GUNJIMA, KOSHI (JP)

(74)代理人：陳長文

(56)參考文獻：

US 2011/0059973A1

WO 2010/034737A1

審查人員：李東秀

申請專利範圍項數：16 項 圖式數：0 共 110 頁

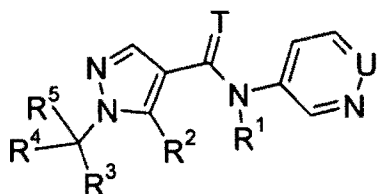
(54)名稱

新穎殺蟲吡唑化合物

NOVEL PESTICIDAL PYRAZOLE COMPOUNDS

(57)摘要

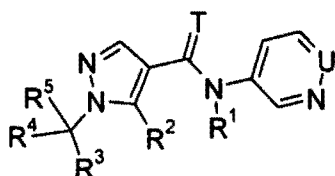
本發明係關於新穎之式 I 吡唑



I

其中變量係如發明說明中所定義；係關於控制無脊椎害蟲之方法、保護植物繁殖材料及/或自其生長之植物之方法，係關於包含至少一種本發明化合物之植物繁殖材料，且係關於農業組合物。

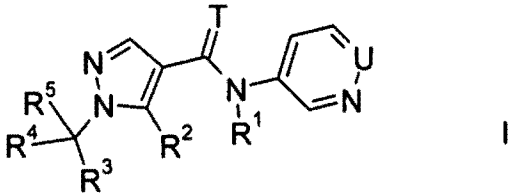
The present invention relates to novel pyrazoles of formula I



I

wherein the variables are as defined in the description, a method for controlling invertebrate pests, a method for protecting plant propagation material and/or the plants which grow there-from, to plant propagation material, comprising at least one compound according to the present invention, and to an agricultural composition.

特徵化學式：



公告本

發明專利說明書

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※ 申請案號：101114261

C07D 305/06 (2006.01)

C07D 307/14 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

※ 申請日：101.4.20

※IPC 分類：A01N 43/58 (2006.01)

A01P 17/00 (2006.01)

A01C 1/08 (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

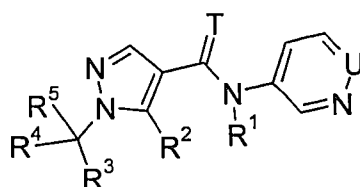
A01P 17/00 (2006.01)

新穎殺蟲吡唑化合物

NOVEL PESTICIDAL PYRAZOLE COMPOUNDS

二、中文發明摘要：

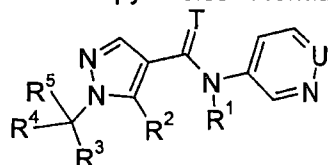
本發明係關於新穎之式I吡唑



其中變量係如發明說明中所定義；係關於控制無脊椎害蟲之方法、保護植物繁殖材料及/或自其生長之植物之方法，係關於包含至少一種本發明化合物之植物繁殖材料，且係關於農業組合物。

三、英文發明摘要：

The present invention relates to novel pyrazoles of formula I



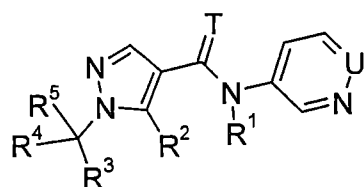
wherein the variables are as defined in the description, a method for controlling invertebrate pests, a method for protecting plant propagation material and/or the plants which grow therefrom, to plant propagation material, comprising at least one compound according to the present invention, and to an agricultural composition.

四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：(無)

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

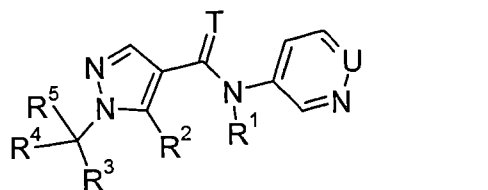


I

六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於新穎之式I吡啶



其中

U 係 N 或 CH；

T 係 O 或 S；

R¹ 係 H、C₁-C₂-烷基或 C₁-C₂-烷氧基-C₁-C₂-烷基；

R² 係 CH₃ 或 鹵甲基；

R³ 係 C₂-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵烷基、C₁-C₂-烷氧基-C₁-C₂-烷基、C₂-C₆-烯基及 C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-環烷基、C₅-C₆-環烯基、C₁-C₆-烷氧基、CN、NO₂ 或 S(O)_nR^b，其中 C 原子可未經取代，或部分地或完全經 R^a 取代；

R^a 係 鹵素、CN、NO₂、C₁-C₂-烷基、C₁-C₂-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₂-鹵烷氧基或 S(O)_nR^b，其中 n 係 0、1 或 2；

R^b 係 氫、C₁-C₂-烷基、C₁-C₂-鹵烷基、C₃-C₆-環烷基或 C₁-C₄-烷氧基，

R⁴ 係 C₁-C₄-烷基或針對 R³ 所提及之基團；

R⁵ 係 H 或針對 R⁴ 所提及之基團；

R³ 及 R⁴ 可一起形成三至六員碳環或雜環，其可含有 1 或 2

個選自 $N-R^c$ 、O及S之雜原子，其中S可經氧化，該碳環或雜環可經 R^a 取代；

R^c 係氫、 C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_2 -鹵烷基、 C_1-C_2 -烷基羰基或 C_1-C_2 -烷氧基羰基；

及其立體異構體、鹽、互變異構體及N-氧化物。

此外，本發明係關於製備式I吡唑之方法及中間體，且亦係關於包含其之活性化合物組合，係關於包含其之組合物且係關於其防治無脊椎害蟲之用途。此外，本發明係關於施加該等化合物之方法。

本發明之其他實施例可參見申請專利範圍、發明說明及實例。應瞭解，上文所提及之本發明標的物之特徵及彼等下文仍闡釋者可不僅應用於各別給定組合中，而且可應用於其他組合中，此不背離本發明之範疇。

【先前技術】

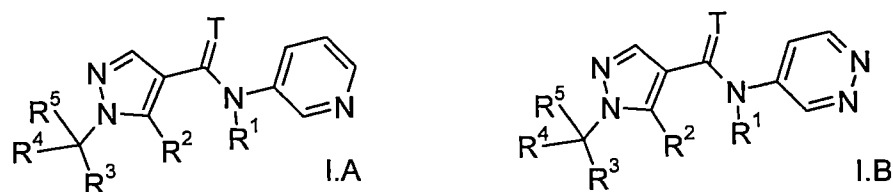
WO 2009/027393、WO 2010/034737、WO 2010/034738及WO 2010/112177闡述自吡唑羧酸衍生之N-芳基醯胺衍生物。所提及此等化合物可用於防治無脊椎害蟲。

無脊椎害蟲且尤其節肢動物及線蟲會毀壞生長中及已收穫之作物並侵襲木製房屋及商業建築物，從而造成食物供應及財產之重大經濟損失。業內一直需要用於防治無脊椎害蟲(例如昆蟲/蜘蛛及線蟲)之新試劑。因此，本發明之目的係提供具有良好殺蟲活性並對諸多不同無脊椎害蟲(尤其對難以控制之害蟲，例如昆蟲)顯示廣譜活性之化合物。

已發現此等目的可藉由如開篇所定義之式I化合物及其立體異構體、鹽、互變異構體及N-氧化物、尤其其農業上可接受之鹽來達成。

【發明內容】

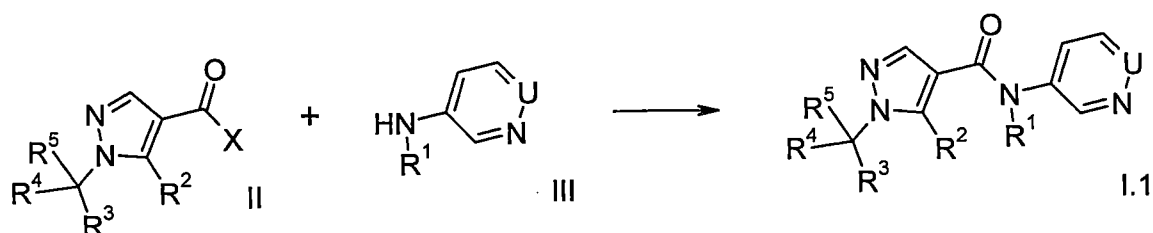
本發明之一實施例係關於式I化合物，其中U係CH。此等化合物對應於式I.A。



本發明之又一實施例係關於式I化合物，其中U係N。此等化合物對應於式I.B。

本發明化合物可根據有機化學標準方法以與 WO 2009/027393及 WO 2010/034737中所述合成途徑類似之方式製備，例如根據以下合成途徑：

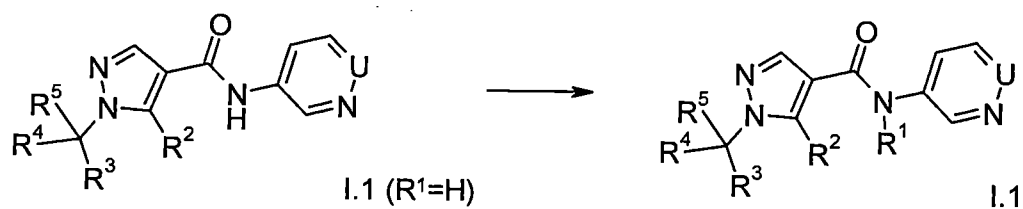
式I化合物(其中T係O)(式I.1)可藉由(例如)使活化吡唑羧酸衍生物II與3-胺基吡啶或式III之4-胺基嘧啶反應來製備(例如 Houben-Weyl:「Methoden der organ. Chemie」[Methods of Organic Chemistry], Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart, New York 1985, 第E5卷, 第941頁至第1045頁)。



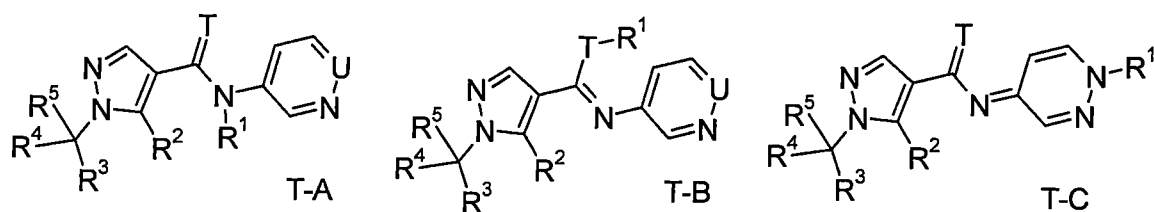
活化吡唑羧酸衍生物II較佳係鹵化物、活化酯、酸酐、疊氮化物，例如鹵化物、氟化物、溴化物、對硝基苯基酯、五氟苯基酯、N-羥基琥珀醯亞胺、羥基苯并三唑-1-基酯。

在式II及III中，該等基團具有上文針對式I所提及之含義且尤其所提及之較佳含義，X係適宜離去基團，例如鹵素、N₃、對硝基苯氧基或五氟苯氧基及諸如此類。

式I.1化合物(其中R¹不同於氫)亦可藉由在鹼存在下使用適宜烷基化試劑將醯胺I.1(其中R¹係氫)烷基化來製備。可在自文獻獲知之標準條件下實施烷基化。



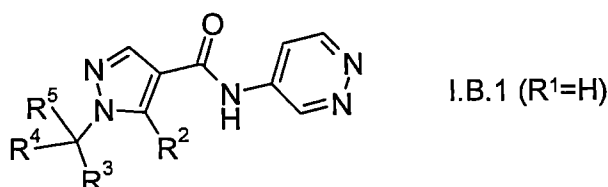
式I化合物可以兩種異構形式存在，且式I.B化合物可以三種異構形式存在，因此式I涵蓋互變異構體T-A及T-B二者，且對於式I.B，亦涵蓋T-C：



為清晰起見，其在整個說明書中僅稱作異構體T-A，但其說明亦涵蓋其他異構體之揭示內容。

異構體T-C可藉由化合物I.B.1(其中R¹係氫)烷基化來獲

得。該反應可與已知嗒咩之N-烷基化類似之方式實施。嗒咩之N-烷基化係於文獻中獲知且可參見例如：J. Chem. Soc., Perkin Trans.第1卷，第401頁(1988)及J. Org. Chem.第46卷，第2467頁(1981)。



式I化合物(其中T係S)(式I.2)可根據Synthesis 2003，第1929頁中所述方法(例如)藉由使式I.1化合物與2,4-雙(4-甲氧基苯基)-1,3,2,4-二硫二磷烷-2,4-二硫化物或PS₅反應來製備。

化合物II及III為業內已知或係自市面購得或可藉由自文獻(參見WO 05/040169；WO 08/074824；Journal of Fluorine chemistry 132(11)，第995頁(2011))獲知之方法製備。

式I化合物之N-氧化物可根據製備雜芳族N-氧化物之標準方法藉由氧化化合物I來製備，例如藉由Journal of Organometallic Chemistry 1989, 370, 17-31中所述方法。

若不能經由上述途徑製備個別化合物，則其可藉由其他化合物I之衍生化或藉由對所述合成途徑之習知改變來製備。舉例而言，在個別情形下，某些化合物I有利地可藉由酯水解、醯胺化、酯化、醚裂解、烯化、還原、氧化及諸如此類自其他化合物I來製備。

可以習知方式處理反應混合物，例如藉由與水混合、分

離各相及(若適當)藉由層析(例如在氧化鋁或矽膠上)純化粗產物來處理。可以無色或淺褐色黏稠油形式獲得一些中間體及終產物，其在減壓及適度高溫下游離於揮發性組份或自揮發性組份純化得到。若以固體形式獲得中間體及終產物，則可藉由重結晶或研磨將其純化。

【實施方式】

術語「本發明化合物」或「式I化合物」包含如本文所定義之化合物以及其立體異構體、鹽、互變異構體或N-氧化物。術語「本發明化合物(compound(s) of the present invention)」應理解為等效於術語「本發明化合物(compound(s) according to the invention)」，因此亦包含其立體異構體、鹽、互變異構體或N-氧化物。

附接至式I骨架之基團可含有一或多個對掌性中心。在此情形下，式I係以不同對映異構體或非對映異構體形式存在，此取決於取代基。本發明係關於式I之每一可能立體異構體，即係關於單一對映異構體或非對映異構體以及其混合物。

式I化合物可為非晶形或可以一或多種不同晶態(多晶型)存在，其可具有不同宏觀性質(例如穩定性)或顯示不同生物學性質(例如活性)。本發明係關於非晶形及結晶式I化合物、各別化合物I之不同晶態之混合物以及其非晶形或結晶鹽。

式I化合物之鹽較佳係農業上可接受之鹽。其可以習用方式形成，例如，若式I化合物具有鹼性官能基，則藉由

使該化合物與所述陰離子之酸反應。

式I化合物之農業上可用鹽尤其涵蓋陽離子及陰離子分別對式I化合物之殺蟲作用無不利影響之彼等酸之酸加成鹽。

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

術語「N-氧化物」包括任一具有至少一個氧化成N-氧化物部分之三級氮原子之式I化合物。

在上述變量定義中所提及之有機部分(例如術語鹵素)係個別群成員之個別列表之統稱。前綴C_n-C_m在每一情形下皆指示基團中可能之碳原子數。

術語「鹵素」在每一情形下皆表示氟、溴、氯或碘，尤其氟、氯或溴。

本文及烷氧基、烷基羰基、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基及烷氧基烷基之烷基部分中所用術語「烷基」在每一情形下皆表示直鏈或具支鏈烷基，其通常具有1至6個碳原子，較佳1至4個碳原子且尤其1至3個碳原子。烷基之實例係甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、2-丁基、異丁基、第三丁基、正戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、

3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、正己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基及1-乙基-2-甲基丙基。

本文及鹵烷氧基、鹵烷硫基鹵烷基羰基、鹵烷基磺醯基及鹵烷基亞磺醯基之鹵烷基部分中所用術語「鹵烷基」在每一情形下皆表示直鏈或具支鏈烷基，其通常具有1至6個碳原子，經常具有1至4個碳原子，其中此基團之氫原子部分地或全部經鹵素原子替代。較佳鹵烷基部分選自C₁-C₂-鹵烷基，尤其C₁-C₂-氟烷基，例如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、五氟乙基及諸如此類。

本文所用術語「烷氧基」在每一情形下皆表示直鏈或具支鏈烷基，其經由氧原子鍵結且通常具有1至6個碳原子，較佳1至4個碳原子。烷氧基之實例係甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、2-丁氧基、異丁氧基、第三丁氧基及諸如此類。

本文及環烷氧基及環烷基甲基之環烷基部分中所用術語「環烷基」在每一情形下皆表示通常具有3至6個碳原子之單環脂族基團，例如環丙基、環丁基、環戊基及環己基。

本文所用術語「烯基」在每一情形下皆表示單不飽和烴基，其通常具有2至6個、較佳2至4個碳原子，例如乙烯基、烯丙基(2-丙烯-1-基)、1-丙烯-1-基、2-丙烯-2-基、甲基烯丙基(2-甲基丙-2-烯-1-基)、2-丁烯-1-基、3-丁烯-1-基、2-戊烯-1-基、3-戊烯-1-基、4-戊烯-1-基、1-甲基丁-2-烯-1-基、2-乙基丙-2-烯-1-基及諸如此類。

本文所用術語「炔基」在每一情形下皆表示通常具有2至6個、較佳2至4個碳原子之單不飽和烴基，例如乙炔基、炔丙基(2-丙炔-1-基)、1-丙炔-1-基、1-甲基丙-2-炔-1-基)、2-丁炔-1-基、3-丁炔-1-基、1-戊炔-1-基、3-戊炔-1-基、4-戊炔-1-基、1-甲基丁-2-炔-1-基、1-乙基丙-2-炔-1-基及諸如此類。

本文所用術語「烷氧基烷基」係指通常包含1至2個碳原子之烷基，其中1個碳原子帶有如上文所定義通常包含1或2個碳原子之烷氧基。實例係 CH_2OCH_3 、 $\text{CH}_2\text{-OC}_2\text{H}_5$ 、2-(甲氧基)乙基及2-(乙氧基)乙基。

術語「雜環基」一般包括5員或6員、尤其6員單環雜環非芳族基團。雜環非芳族基團通常包含1、2或3個選自N、O及S之雜原子作為環成員，其中作為環成員之S原子可以S、SO或 SO_2 形式存在。

5或6員雜環基團之實例包含飽和或不飽和非芳族雜環，例如環氧乙烷基、氧雜丁環基、硫雜環丁基、硫雜環丁基-S-氧化物(S-側氧基硫雜環丁基)、硫雜環丁基-S-二氧化物(S-二側氧基硫雜環丁基)、吡咯啉基、吡咯啉基、吡啶

啉基、四氫呋喃基、二氫呋喃基、1,3-二氧戊環基、硫雜環戊基、S-側氧基硫雜環戊基、S-二側氧基硫雜環戊基、二氫噻吩基、S-側氧基二氫噻吩基、S-二側氧二氫噻吩基、噁唑啉基、噁唑啉基、噻唑啉基、氧雜硫雜環戊基、六氫吡啶基、六氫吡嗪基、吡喃基、二氫吡喃基、四氫吡喃基、1,3-二噁烷基及1,4-二噁烷基、硫吡喃基、S-側氧基硫吡喃基、S-二側氧硫吡喃基、二氫硫吡喃基、S-側氧基二氫硫吡喃基、S-二側氧二氫硫吡喃基、四氫硫吡喃基、S-側氧基四氫硫吡喃基、S-二側氧四氫硫吡喃基、嗎啉基、硫嗎啉基、S-側氧基硫嗎啉基、S-二側氧硫嗎啉基、噻吡基及諸如此類。亦包含1或2個羰基作為環成員之雜環之實例包含吡咯啉-2-酮基、吡咯啉-2,5-二酮基、咪唑啉-2-酮基、噁唑啉-2-酮基、噻唑啉-2-酮基及諸如此類。

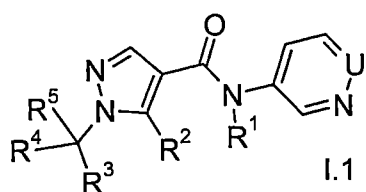
對於變量而言，中間體之尤佳實施例對應於式I之彼等基團。

在具體實施例中，式I化合物之變量具有以下含義，此等含義單獨及彼此組合均係式I化合物之具體實施例：

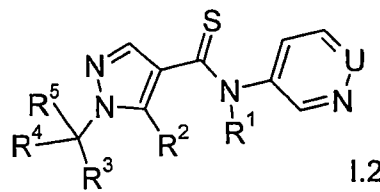
在式I化合物之一較佳實施例中，U係CH。此等化合物對應於式I.A。

在式I化合物之又一實施例中，U係N。此等化合物對應於式I.B。

在式I之第一較佳實施例中，T係O。此等化合物對應於式I.1。



I.1



I.2

在式 I 之另一實施例中，T 係 S。此等化合物對應於式 I.2。

在第一實施例中， R^1 係 H。

在又一實施例中， R^1 係 C_1 - C_2 -烷基，較佳係 CH_3 。

在又一實施例中， R^1 係 CH_2CH_3 。

在又一實施例中， R^1 係 C_1 - C_2 -烷氧基- C_1 - C_2 -烷基，較佳係 C_1 - C_2 -烷氧基-甲基，尤其 CH_2OCH_3 。

在第一實施例中， R^2 係 CH_3 。

在又一實施例中， R^2 係鹵甲基，較佳係氟甲基，尤其 CHF_2 或 CF_3 。

在第一較佳實施例中， R^3 係 C_2 - C_6 -烷基，較佳係 C_2 - C_4 -烷基，尤其 CH_2CH_3 或 $C(CH_3)_3$ 。

在另一較佳實施例中， R^3 係 C_1 - C_6 -鹵烷基，較佳係 C_1 - C_2 -烷基，更佳係甲基，例如 CHF_2 或 CF_3 ，尤其 CF_3 。

在另一較佳實施例中， R^3 係 C_1 - C_2 -烷氧基- C_1 - C_2 -烷基，較佳係 C_1 - C_2 -烷氧基-甲基，尤其 CH_2OCH_3 。

在另一較佳實施例中， R^3 係 C_3 - C_6 -環烷基，較佳係環丙基，其未經取代或經取代，較佳經鹵素或氰基取代。取代基較佳位於 1-位或 2,2-位。

在第一較佳實施例中， R^4 係 C_1 - C_4 -烷基，較佳係 C_1 - C_2 -烷基，尤其 CH_3 。

在另一較佳實施例中， R^4 係 C_1-C_6 -鹵烷基，較佳係 C_1-C_2 -烷基，尤其鹵甲基，例如 CF_3 。

在又一實施例中， R^4 係 C_3-C_6 -環烷基，較佳係環丙基，其可經取代，較佳經鹵素或氰基取代。取代基較佳位於1-位或2,2-位。

在第一較佳實施例中， R^5 係氫。

在另一較佳實施例中， R^5 係CN或 NO_2 ，較佳係CN。

在另一較佳實施例中， R^5 係 C_1-C_4 -烷基，較佳係 C_1-C_2 -烷基，尤其 CH_3 。

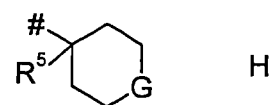
在另一實施例中， R^3 及 R^4 形成五或六員飽和碳環，例如環戊基或環己基，其未經取代或經一或多個基團 R^a 取代。該等 R^a 基團較佳係鹵素、氰基或鹵甲基。

在另一實施例中， R^3 及 R^4 形成五或六員飽和雜環，其含有1或2個、較佳1個選自 $N-R^c$ 、O及S之雜原子，其中S可經氧化，該雜環未經取代或經一或多個基團 R^d 取代。

R^c 較佳表示 C_1-C_2 -烷基，尤其 CH_3 ；或 C_1-C_2 -烷基羰基，尤其乙醯基。

該雜環較佳未經取代。

在一實施例中，由 R^3 及 R^4 形成之雜環代表基團H：



其中G代表 $N-R^c$ 、O、S、 $S(=O)$ 或 SO_2 ，且#表示至吡唑部分之鍵。

另一實施例係關於式I化合物(不包括外消旋化合物)，其

中 T 係 O， R^1 係 H、 C_1-C_2 -烷基或 CH_2OCH_3 ， R^2 係 CH_3 、 CHF_2 或 CF_3 ， R^3 係 CF_3 或環丙基， R^4 係 CH_3 ，且 R^5 係 H。

尤其考慮到其用途，較佳者係下表中所彙集之式 I 化合物，該等化合物對應於式 I.1。此外，針對表中取代基所提及之基團中之每一者本身(獨立於提及該基團之組合)係所述取代基之尤佳態樣。

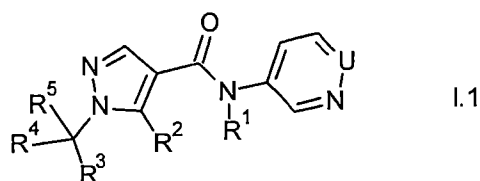


表 1

式 I.1 化合物，其中 U 係 CH， R^1 係 H， R^2 係 CH_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表 A 之一列

表 2

式 I.1 化合物，其中 U 係 N， R^1 係 H， R^2 係 CH_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表 A 之一列

表 3

式 I.1 化合物，其中 U 係 CH， R^1 係 H， R^2 係 CHF_2 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表 A 之一列

表 4

式 I.1 化合物，其中 U 係 N， R^1 係 H， R^2 係 CHF_2 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表 A 之一列

表 5

式 I.1 化合物，其中 U 係 CH， R^1 係 H， R^2 係 CF_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表 A 之一列

表 6

式 I.1 化合物，其中 U 係 N， R^1 係 H， R^2 係 CF_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表 A 之一列

表 7

式 I.1 化合物，其中 U 係 CH， R^1 及 R^2 係 CH_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表 A 之一列

表 8

式 I.1 化合物，其中 U 係 N， R^1 及 R^2 係 CH_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表 A 之一列

表 9

式 I.1 化合物，其中 U 係 CH， R^1 係 CH_3 ， R^2 係 CHF_2 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表 A 之一列

表 10

式 I.1 化合物，其中 U 係 N， R^1 係 CH_3 ， R^2 係 CHF_2 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表 A 之一列

表 11

式 I.1 化合物，其中 U 係 CH， R^1 係 CH_3 ， R^2 係 CF_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表 A 之一列

表 12

式 I.1 化合物，其中 U 係 N， R^1 係 CH_3 ， R^2 係 CF_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表 A 之一列

表 13

式I.1化合物，其中U係CH， R^1 係 CH_2CH_3 ， R^2 係 CH_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表A之一列

表 14

式I.1化合物，其中U係N， R^1 係 CH_2CH_3 ， R^2 係 CH_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表A之一列

表 15

式I.1化合物，其中U係CH， R^1 係 CH_2CH_3 ， R^2 係 CHF_2 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表A之一列

表 16

式I.1化合物，其中U係N， R^1 係 CH_2CH_3 ， R^2 係 CHF_2 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表A之一列

表 17

式I.1化合物，其中U係CH， R^1 係 CH_2CH_3 ， R^2 係 CF_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表A之一列

表 18

式I.1化合物，其中U係N， R^1 係 CH_2CH_3 ， R^2 係 CF_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表A之一列

表 19

式I.1化合物，其中U係CH， R^1 係 CH_2OCH_3 ， R^2 係 CH_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表A之一列

表 20

式I.1化合物，其中U係N， R^1 係 CH_2OCH_3 ， R^2 係 CH_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表A之一列

物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表A之一列

表 21

式 I.1 化合物，其中 U 係 CH， R^1 係 CH_2OCH_3 ， R^2 係 CHF_2 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表A之一列

表 22

式 I.1 化合物，其中 U 係 N， R^1 係 CH_2OCH_3 ， R^2 係 CHF_2 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表A之一列

表 23

式 I.1 化合物，其中 U 係 CH， R^1 係 CH_2OCH_3 ， R^2 係 CF_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表A之一列

表 24

式 I.1 化合物，其中 U 係 N， R^1 係 CH_2OCH_3 ， R^2 係 CF_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表A之一列

表 25

式 I.1 化合物，其中 U 係 CH， R^1 係 $CH_2OCH_2CH_3$ ， R^2 係 CH_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表A之一列

表 26

式 I.1 化合物，其中 U 係 N， R^1 係 $CH_2OCH_2CH_3$ ， R^2 係 CH_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表A之一列

表 27

式 I.1 化合物，其中 U 係 CH， R^1 係 $CH_2OCH_2CH_3$ ， R^2 係 CHF_2 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表 A 之一列

表 28

式 I.1 化合物，其中 U 係 N， R^1 係 $CH_2OCH_2CH_3$ ， R^2 係 CHF_2 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表 A 之一列

表 29

式 I.1 化合物，其中 U 係 CH， R^1 係 $CH_2OCH_2CH_3$ ， R^2 係 CF_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表 A 之一列

表 30

式 I.1 化合物，其中 U 係 N， R^1 係 $CH_2OCH_2CH_3$ ， R^2 係 CF_3 且化合物之 R^3 、 R^4 及 R^5 之組合在每一情形下皆對應於表 A 之一列

表 A

編號	R^3	R^4	R^5	編號	R^3	R^4	R^5
A-1	CN	CH_3	H	A-7	c- C_3H_5	CH_3	H
A-2	CH_2CH_3	CH_3	H	A-8	1-F-c- C_3H_4	CH_3	H
A-3	$C(CH_3)_3$	CH_3	H	A-9	1-CN-c- C_3H_4	CH_3	H
A-4	CHF_2	CH_3	H	A-10	2,2-F ₂ -c- C_3H_3	CH_3	H
A-5	CF_3	CH_3	H	A-11	2,2-Cl ₂ -c- C_3H_3	CH_3	H
A-6	CH_2OCH_3	CH_3	H	A-12	c- C_4H_7	CH_3	H

編號	R ³	R ⁴	R ⁵	編號	R ³	R ⁴	R ⁵
A-13	c-C ₅ H ₉	CH ₃	H	A-53	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃
A-14	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	H	A-54	C(CH ₃) ₃	CH ₃	CH ₃
A-15	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	H	A-55	CHF ₂	CH ₃	CH ₃
A-16	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	H	A-56	CF ₃	CH ₃	CH ₃
A-17	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	H	A-57	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃
A-18	CN	CH ₂ CH ₃	H	A-58	c-C ₃ H ₅	CH ₃	CH ₃
A-19	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	A-59	1-F-c-C ₃ H ₄	CH ₃	CH ₃
A-20	C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	H	A-60	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₃	CH ₃
A-21	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	H	A-61	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	CH ₃
A-22	CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	A-62	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	CH ₃
A-23	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	H	A-63	c-C ₄ H ₇	CH ₃	CH ₃
A-24	c-C ₃ H ₅	CH ₂ CH ₃	H	A-64	c-C ₅ H ₉	CH ₃	CH ₃
A-25	1-F-c-C ₃ H ₄	CH ₂ CH ₃	H	A-65	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	CH ₃
A-26	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₂ CH ₃	H	A-66	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	CH ₃
A-27	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₂ CH ₃	H	A-67	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	CH ₃
A-28	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₂ CH ₃	H	A-68	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	CH ₃
A-29	c-C ₄ H ₇	CH ₂ CH ₃	H	A-69	CN	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-30	c-C ₅ H ₉	CH ₂ CH ₃	H	A-70	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-31	c-C ₆ H ₁₁	CH ₂ CH ₃	H	A-71	C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-32	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	H	A-72	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-33	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	H	A-73	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-34	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	H	A-74	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-35	CN	CF ₃	H	A-75	c-C ₃ H ₅	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-36	CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	A-76	1-F-c-C ₃ H ₄	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-37	C(CH ₃) ₃	CF ₃	H	A-77	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-38	CHF ₂	CF ₃	H	A-78	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-39	CF ₃	CF ₃	H	A-79	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-40	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	A-80	c-C ₄ H ₇	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-41	c-C ₃ H ₅	CF ₃	H	A-81	c-C ₅ H ₉	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-42	1-F-c-C ₃ H ₄	CF ₃	H	A-82	c-C ₆ H ₁₁	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-43	1-CN-c-C ₃ H ₄	CF ₃	H	A-83	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-44	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CF ₃	H	A-84	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-45	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CF ₃	H	A-85	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-46	c-C ₄ H ₇	CF ₃	H	A-86	CN	CF ₃	CH ₃
A-47	c-C ₅ H ₉	CF ₃	H	A-87	CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃
A-48	c-C ₆ H ₁₁	CF ₃	H	A-88	C(CH ₃) ₃	CF ₃	CH ₃
A-49	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	H	A-89	CHF ₂	CF ₃	CH ₃
A-50	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	H	A-90	CF ₃	CF ₃	CH ₃
A-51	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	H	A-91	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	CH ₃
A-52	CN	CH ₃	CH ₃	A-92	c-C ₃ H ₅	CF ₃	CH ₃

編號	R ³	R ⁴	R ⁵	編號	R ³	R ⁴	R ⁵
A-93	1-F-c-C ₃ H ₄	CF ₃	CH ₃	A-133	C(CH ₃) ₃	CH ₃	CN
A-94	1-CN-c-C ₃ H ₄	CF ₃	CH ₃	A-134	CHF ₂	CH ₃	CN
A-95	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CF ₃	CH ₃	A-135	CF ₃	CH ₃	CN
A-96	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CF ₃	CH ₃	A-136	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CN
A-97	c-C ₄ H ₇	CF ₃	CH ₃	A-137	c-C ₃ H ₅	CH ₃	CN
A-98	c-C ₅ H ₉	CF ₃	CH ₃	A-138	1-F-c-C ₃ H ₄	CH ₃	CN
A-99	c-C ₆ H ₁₁	CF ₃	CH ₃	A-139	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₃	CN
A-100	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	CH ₃	A-140	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	CN
A-101	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	CH ₃	A-141	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	CN
A-102	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	CH ₃	A-142	c-C ₄ H ₇	CH ₃	CN
A-103	c-C ₃ H ₅	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-143	c-C ₅ H ₉	CH ₃	CN
A-104	1-F-c-C ₃ H ₄	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-144	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	CN
A-105	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-145	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	CN
A-106	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-146	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	CN
A-107	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-147	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	CN
A-108	c-C ₄ H ₇	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-148	CN	CH ₂ CH ₃	CN
A-109	c-C ₅ H ₉	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-149	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CN
A-110	c-C ₆ H ₁₁	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-150	C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	CN
A-111	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-151	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	CN
A-112	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-152	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CN
A-113	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-153	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	CN
A-114	CN	CF ₃	CF ₃	A-154	c-C ₃ H ₅	CH ₂ CH ₃	CN
A-115	CH ₂ CH ₃	CF ₃	CF ₃	A-155	1-F-c-C ₃ H ₄	CH ₂ CH ₃	CN
A-116	C(CH ₃) ₃	CF ₃	CF ₃	A-156	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₂ CH ₃	CN
A-117	CHF ₂	CF ₃	CF ₃	A-157	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₂ CH ₃	CN
A-118	CF ₃	CF ₃	CF ₃	A-158	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₂ CH ₃	CN
A-119	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	CF ₃	A-159	c-C ₄ H ₇	CH ₂ CH ₃	CN
A-120	c-C ₃ H ₅	CF ₃	CF ₃	A-160	c-C ₅ H ₉	CH ₂ CH ₃	CN
A-121	1-F-c-C ₃ H ₄	CF ₃	CF ₃	A-161	c-C ₆ H ₁₁	CH ₂ CH ₃	CN
A-122	1-CN-c-C ₃ H ₄	CF ₃	CF ₃	A-162	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	CN
A-123	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CF ₃	CF ₃	A-163	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	CN
A-124	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CF ₃	CF ₃	A-164	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	CN
A-125	c-C ₄ H ₇	CF ₃	CF ₃	A-165	CN	CF ₃	CN
A-126	c-C ₅ H ₉	CF ₃	CF ₃	A-166	CH ₂ CH ₃	CF ₃	CN
A-127	c-C ₆ H ₁₁	CF ₃	CF ₃	A-167	C(CH ₃) ₃	CF ₃	CN
A-128	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	CF ₃	A-168	CHF ₂	CF ₃	CN
A-129	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	CF ₃	A-169	CF ₃	CF ₃	CN
A-130	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	CF ₃	A-170	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	CN
A-131	CN	CH ₃	CN	A-171	c-C ₃ H ₅	CF ₃	CN
A-132	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	A-172	1-F-c-C ₃ H ₄	CF ₃	CN

No.	R ³	R ⁴	R ⁵	No.	R ³	R ⁴	R ⁵
編號 3	1-CN-c-C ₃ H ₄	CF ₃	CN	編號 3	-CH ₂ CF ₂ -		CF ₃
A-174	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CF ₃	CN	A-193	-CH ₂ CCl ₂ -		CF ₃
A-175	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CF ₃	CN	A-194	-CH ₂ CH ₂ -CH ₂ -		CF ₃
A-176	c-C ₄ H ₇	CF ₃	CN	A-195	-CH ₂ CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		CF ₃
A-177	c-C ₅ H ₉	CF ₃	CN	A-196	-CH ₂ CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ CH ₂ -		CF ₃
A-178	c-C ₆ H ₁₁	CF ₃	CN	A-197	-CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ -		CF ₃
A-179	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	CN	A-198	-CH ₂ CH ₂ -N(CH ₃)-CH ₂ CH ₂ -		CF ₃
A-180	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	CN	A-199	-CH ₂ CH ₂ N(COCH ₃)CH ₂ CH ₂ -		CF ₃
A-181	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	CN	A-200	-CH ₂ CH ₂ -		CN
A-182	-CH ₂ CH ₂ -		H	A-201	-CH ₂ CF ₂ -		CN
A-183	-CH ₂ CF ₂ -		H	A-202	-CH ₂ CCl ₂ -		CN
A-184	-CH ₂ CCl ₂ -		H	A-203	-CH ₂ CH ₂ -CH ₂ -		CN
A-185	-CH ₂ CH ₂ -CH ₂ -		H	A-204	-CH ₂ CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		CN
A-186	-CH ₂ CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		H	A-205	-CH ₂ CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ CH ₂ -		CN
A-187	-CH ₂ CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ CH ₂ -		H	A-206	-CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ -		CN
A-188	-CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ -		H	A-207	-CH ₂ CH ₂ -N(CH ₃)-CH ₂ CH ₂ -		CN
A-189	-CH ₂ CH ₂ -N(CH ₃)-CH ₂ CH ₂ -		H	A-208	-CH ₂ CH ₂ N(COCH ₃)CH ₂ CH ₂ -		CN
A-190	-CH ₂ CH ₂ N(COCH ₃)CH ₂ CH ₂ -		H				
A-191	-CH ₂ CH ₂ -		CF ₃				

由於本發明化合物之極佳活性，故其可用於控制無脊椎害蟲。

因此，本發明亦提供控制無脊椎害蟲之方法，該方法包含用殺蟲有效量之如上文所定義之本發明化合物或組合物處理害蟲、其食物供應、其棲息地或其繁殖地；或生長或可生長害蟲之栽培植物、植物繁殖材料(例如種子)、土壤、區域、材料或環境；或欲防止受到害蟲侵襲或侵擾之材料、栽培植物、植物繁殖材料(例如種子)、土壤、表面或空間。

本發明亦係關於保護生長植物不受無脊椎害蟲、較佳昆蟲種群侵襲或侵擾之方法，該方法包含使植物、或生長或可生長植物之土壤或水與殺蟲有效量之至少一種本發明化

合物(包括其立體異構體、鹽、互變異構體或N-氧化物)或本發明組合物接觸。

較佳地，本發明方法用於保護植物繁殖材料(例如種子)及自其生長之植物免受無脊椎害蟲侵襲或侵擾，且包含用殺蟲有效量之如上文所定義之本發明化合物或用殺蟲有效量之如上文及下文中所定義之農業組合物處理植物繁殖材料(例如種子)。本發明方法並不限於對已根據本發明處理之「基質」(植物、植物繁殖材料、土壤材料等)之保護，且由此對自經處理植物繁殖材料(例如種子)生長之植物亦具有預防性效應(例如與經處理植物繁殖材料一致之保護)，其中該植物自身係未經處理。

就本發明而言，「無脊椎害蟲」較佳選自節肢動物及線蟲，更佳選自有害昆蟲、蜘蛛及線蟲，且甚至更佳選自昆蟲、蟎蟲及線蟲。在本發明之含義中，「無脊椎害蟲」最佳係昆蟲。

本發明化合物(包括其鹽、立體異構體及互變異構體)尤其適於有效地控制節肢害蟲，例如蜘蛛、蜈蚣及昆蟲以及線蟲，尤其昆蟲。其尤其適於有效地防治或控制以下害蟲：

來自鱗翅目(鱗翅目(Lepidoptera))之昆蟲，例如球莖夜蛾(*Agrotis ypsilon*)、蕪菁夜蛾(*Agrotis segetum*)、棉樹葉蟲(*Alabama argillacea*)、黎豆夜蛾(*Anticarsia gemmatilis*)、蘋實巢蛾(*Argyresthia conjugella*)、丫紋夜蛾(*Autographa gamma*)、松尺蠖(*Bupalus piniarius*)、樅卷

葉蛾 (*Cacoecia murinana*)、蘋小卷葉蛾 (*Capua reticulana*)、冬尺蛾 (*Cheimatobia brumata*)、雲杉卷葉蛾 (*Choristoneura fumiferana*)、西方雲杉卷葉蛾 (*Choristoneura occidentalis*)、栗夜蛾 (*Cirphis unipuncta*)、蘋果蠹蛾 (*Cydia pomonella*)、歐洲松毛蟲 (*Dendrolimus pini*)、瓜野螟 (*Diaphania nitidalis*)、西南玉米螟 (*Diatraea grandiosella*)、埃及鑽夜蛾 (*Earias insulana*)、南美玉米苗斑螟 (*Elasmopalpus lignosellus*)、葡萄與蘋果捲葉蛾 (*Eupoecilia ambiguella*)、歐洲松梢小卷蛾 (*Evetria bouliana*)、粒膚地老虎 (*Feltia subterranean*)、大蠟蛾 (*Galleria mellonella*)、李小食心蟲 (*Grapholitha funebrana*)、梨小食心蟲 (*Grapholitha molesta*)、番茄夜蛾 (*Heliothis armigera*)、菸草夜蛾 (*Heliothis virescens*)、亞麻夜蛾 (*Heliothis zea*)、菜心螟 (*Hellula undalis*)、暗點赫尺蛾 (*Hibernia defoliaria*)、美國白蛾 (*Hyphantria cunea*)、蘋果巢蛾 (*Hyponomeuta malinellus*)、蕃茄蠹蛾 (*Keiferia lycopersicella*)、鐵杉尺蠖 (*Lambdina fiscellaria*)、甜菜夜蛾 (*Laphygma exigua*)、咖啡潛夜蛾 (*Leucoptera coffeella*)、旋紋潛葉蛾 (*Leucoptera scitella*)、斑幕潛葉蛾 (*Lithocolletis blancardella*)、葡萄小卷葉蛾 (*Lobesia botrana*)、草地螟 (*Loxostege sticticalis*)、舞毒蛾 (*Lymantria dispar*)、松針毒蛾 (*Lymantria monacha*)、桃潛葉蛾 (*Lyonetia clerkella*)、天幕枯葉蛾 (*Malacosoma neustria*)、甘藍夜蛾 (*Mamestra brassicae*)、黃杉毒蛾

(*Orgyia pseudotsugata*)、歐洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis*)、冬夜蛾(*Panolis flammea*)、紅鈴蟲(*Pectinophora gossypiella*)、雜色夜蛾(*Peridroma saucia*)、圓黃掌舟蛾(*Phalera bucephala*)、馬鈴薯蠹蛾(*Phthorimaea operculella*)、柑桔潛葉蛾(*Phyllocnistis citrella*)、大菜粉蛾(*Pieris brassicae*)、苜蓿綠夜蛾(*Plathypena scabra*)、小菜蛾(*Plutella xylostella*)、大豆夜蛾(*Pseudoplusia includens*)、松梢卷葉蛾(*Rhyacionia frustrana*)、馬鈴薯塊莖蛾(*Scrobipalpula absoluta*)、麥蛾(*Sitotroga cerealella*)、葡萄長須卷葉蛾(*Sparganothis pilleriana*)、草地夜蛾(*Spodoptera frugiperda*)、灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis*)、斜紋夜蛾(*Spodoptera litura*)、松異周蛾(*Thaumtopoea pityocampa*)、櫟綠卷葉蛾(*Tortrix viridana*)、粉紋夜蛾(*Trichoplusia ni*)及雲杉小卷葉蛾(*Zeiraphera canadensis*)；

甲蟲(鞘翅目(*Coleoptera*))，例如梨長吉丁(*Agrilus sinuatus*)、具條叩甲(*Agriotes lineatus*)、暗紋叩甲(*Agriotes obscurus*)、馬鈴薯鰓金龜(*Amphimallon solstitialis*)、異形小蠹(*Anisandrus dispar*)、棉鈴象甲(*Anthonomus grandis*)、蘋果花象甲(*Anthonomus pomorum*)、優繭蜂側刺葉蚤(*Aphthona euphoridae*)、點擊甲蟲(*Athous haemorrhoidalis*)、甜菜隱食甲(*Atomaria linearis*)、松縱坑切梢小蠹(*Blastophagus piniperda*)、粗紋小蜂(*Blitophaga undata*)、蠶豆象(*Bruchus rufimanus*)、豌豆

豆象(*Bruchus pisorum*)、歐洲兵豆象(*Bruchus lentis*)、蘋果卷葉象甲(*Byctiscus betulae*)、甜菜大龜甲(*Cassida nebulosa*)、豆葉甲(*Cerotoma trifurcata*)、金花金龜(*Cetonia aurata*)、甘藍莢象甲(*Ceuthorrhynchus assimilis*)、油菜龜象甲(*Ceuthorrhynchus napi*)、甜菜莖跳甲(*Chaetocnema tibialis*)、煙草金針蟲(*Conoderus vespertinus*)、天門冬葉甲(*Crioceris asparagi*)、叩頭蟲亞種(*Ctenicera* ssp)、長角葉甲(*Diabrotica longicornis*)、黃瓜半星葉甲(*Diabrotica semipunctata*)、十二星瓜葉甲(*Diabrotica 12-punctata*)、巴西葉甲(*Diabrotica speciosa*)、玉米根葉甲(*Diabrotica virgifera*)、墨西哥豆瓢蟲(*Epilachna varivestis*)、煙草跳甲(*Epitrix hirtipennis*)、棉籽灰象(*Eutinobothrus brasiliensis*)、松樹皮象(*Hylobius abietis*)、埃及苜蓿象甲(*Hypera brunneipennis*)、苜蓿葉象甲(*Hypera postica*)、雲杉八齒小蠹(*Ips typographus*)、具條負泥蟲(*Lema bilineata*)、黑角負泥蟲(*Lema melanopus*)、馬鈴薯甲蟲(*Leptinotarsa decemlineata*)、甜菜金針蟲(*Limonius californicus*)、稻象甲(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、蘆葦叩頭蟲(*Melanotus communis*)、油菜露尾甲(*Meligethes aeneus*)、忽布鰓角金龜(*Melolontha hippocastani*)、歐洲鰓金龜(*Melolontha melolontha*)、稻負泥蟲(*Oulema oryzae*)、葡萄黑耳喙象(*Ortiorrhynchus sulcatus*)、草莓根象甲(*Otiorrhynchus ovatus*)、辣根猿葉甲(*Phaedon cochleariae*)、梨切葉象(*Phyllobius pyri*)、油

菜藍跳甲(*Phyllotreta chrysocephala*)、金龜屬(*Phyllophaga* sp.)、犀角金龜(*Phyllopertha horticola*)、大豆淡足跳甲(*Phyllotreta nemorum*)、黃曲條跳甲(*Phyllotreta striolata*)、日本麗金龜(*Popillia japonica*)、豌豆葉象甲(*Sitona lineatus*)及谷象(*Sitophilus granaria*)；

蠅、蚊(雙翅目(Diptera))，例如埃及伊蚊(*Aedes aegypti*)、白紋伊蚊(*Aedes albopictus*)、刺擾伊蚊(*Aedes vexans*)、墨西哥果實蠅(*Anastrepha ludens*)、五斑按蚊(*Anopheles maculipennis*)、災難按蚊(*Anopheles crucians*)、淡色按蚊(*Anopheles albimanus*)、岡比亞按蚊(*Anopheles gambiae*)、泛生按蚊(*Anopheles freeborni*)、白踝按蚊(*Anopheles leucosphyrus*)、微小按蚊(*Anopheles minimus*)、四斑按蚊(*Anopheles quadrimaculatus*)、紅頭麗蠅(*Calliphora vicina*)、地中海果實蠅(*Ceratitis Capitata*)、蛆症金蠅(*Chrysomya bezziana*)、螺旋金蠅(*Chrysomya hominivorax*)、腐敗錐蠅(*Chrysomya macellaria*)、中室斑虻(*Chrysops discalis*)、靜斑虻(*Chrysops silacea*)、大西洋斑虻(*Chrysops atlanticus*)、螺旋蠅(*Cochliomyia hominivorax*)、高粱癭蚊(*Contarinia sorghicola*)、嗜人瘤蠅(*Cordylobia anthropophaga*)、毛庫蠅(*Culicoides furens*)、尖音庫蚊(*Culex pipiens*)、黑須庫蚊(*Culex nigripalpus*)、致倦庫蚊(*Culex quinquefasciatus*)、跗斑庫蚊(*Culex tarsalis*)、純色脈毛蚊(*Culiseta inornata*)、黑尾脈毛蚊(*Culiseta melanura*)、瓜實蠅(*Dacus cucurbitae*)、橄

欖實蠅 (*Dacus oleae*)、芸苔莢癭蚊 (*Dasineura brassicae*)、
 蔥地種蠅 (*Delia antique*)、麥地種蠅 (*Delia coarctata*)、灰
 地種蠅 (*Delia platura*)、甘藍地種蠅 (*Delia radicum*)、人膚
 蠅 (*Dermatobia hominis*)、黃腹廁蠅 (*Fannia canicularis*)、
 三點禾蠅 (*Geomyza Tripunctata*)、馬腸胃蠅 (*Gasterophilus*
intestinalis)、刺舌蠅 (*Glossina morsitans*)、須舌蠅
 (*Glossina palpalis*)、引舌蠅 (*Glossina fuscipes*)、膠舌蠅
 (*Glossina tachinoides*)、東方臂蠅 (*Haematobia irritans*)、
 桃紅癭蚊 (*Haplodiplosis equestris*)、潛蠅屬 (*Hippelates*
spp.)、種蠅 (*Hylemyia platura*)、紋皮蠅 (*Hypoderma*
lineata)、急流細蠓 (*Leptoconops torrens*)、蔬菜斑潛蠅
 (*Liriomyza sativae*)、非洲菊斑潛蠅 (*Liriomyza trifolii*)、羊
 綠蠅 (*Lucilia caprina*)、銅綠蠅 (*Lucilia cuprina*)、絲光綠蠅
 (*Lucilia sericata*)、寡毛蠅 (*Lycoria pectoralis*)、曼蚊 (*Mansonia*
titillanus)、黑森癭蚊 (*Mayetiola destructor*)、秋家蠅 (*Musca*
autumnalis)、家蠅 (*Musca domestica*)、廐腐蠅 (*Muscina*
stabulans)、羊鼻蠅 (*Oestrus ovis*)、禾蠅 (*Opomyza florum*)、瑞
 典麥桿蠅 (*Oscinella frit*)、甜菜潛葉蠅 (*Pegomya hysocyami*)、
 蔥蠅 (*Phorbia antiqua*)、甘藍種蠅 (*Phorbia brassicae*)、麥種蠅
 (*Phorbia coarctata*)、銀足白蛉 (*Phlebotomus argentipes*)、哥倫
 比亞鱗蚊 (*Psorophora columbiae*)、胡蘿蔔莖蠅 (*Psila rosae*)、
 異色鱗蚊 (*Psorophora discolor*)、混合墨蚊 (*Prosimulium*
mixtum)、櫻桃實蠅 (*Rhagoletis Cerasi*)、蘋果實蠅
 (*Rhagoletis pomonella*)、紅尾肉蠅 (*Sarcophaga*

haemorrhoidalis)、肉 蠅 屬 (*Sarcophaga* spp.)、帶 蚋 (*Simulium vittatum*)、廢 刺 蠅 (*Stomoxys calcitrans*)、牛 虻 (*Tabanus bovinus*)、黑 虻 (*Tabanus atratus*)、具 條 牛 虻 (*Tabanus lineola*)及 擬 原 虻 (*Tabanus similis*)、沼 澤 大 蚊 (*Tipula oleracea*)及 歐 洲 大 蚊 (*Tipula paludosa*)；

薊 馬 (纓翅目 (*Thysanoptera*))，例如 蘭 花 薊 馬、薊 馬 亞 種 (*Dichromothrips* ssp.)、褐 花 薊 馬 (*Frankliniella fusca*)、西 花 薊 馬 (*Frankliniella occidentalis*)、東 方 花 卉 薊 馬 (*Frankliniella tritici*)、柑 桔 薊 馬 (*Scirtothrips citri*)、稻 薊 馬 (*Thrips oryzae*)、南 黃 薊 馬 (*Thrips palmi*)及 棉 薊 馬 (*Thrips tabaci*)，

白 蟻 (等翅目 (*Isoptera*))，例如 乾 木 白 蟻 (*Calotermes flavicollis*)、歐 美 散 白 蟻 (*Leucotermes flavipes*)、南 美 異 白 蟻 (*Heterotermes aureus*)、黃 肢 散 白 蟻 (*Reticulitermes flavipes*)、南 方 散 白 蟻 (*Reticulitermes virginicus*)、南 歐 網 紋 散 白 蟻 (*Reticulitermes lucifugus*)、桑 特 散 白 蟻 (*Reticulitermes santonensis*)、格 蘭 散 白 蟻 (*Reticulitermes grassei*)、納 塔 爾 白 蟻 (*Termes natalensis*)及 家 白 蟻 (*Coptotermes formosanus*)；

蟑 螂 (蟑螂目 (*Blattaria*)-蟑 螂 科 (*Blattodea*))，例如 德 國 蟑 螂 (*Blattella germanica*)、亞 洲 蟑 螂 (*Blattella asahinae*)、美 洲 蟑 螂 (*Periplaneta americana*)、日 本 蟑 螂 (*Periplaneta japonica*)、褐 色 蟑 螂 (*Periplaneta brunnea*)、黑 胸 蟑 螂 (*Periplaneta fuliginosa*)、澳 洲 蟑 螂 (*Periplaneta*

australasiae)及東方蟑螂(*Blatta orientalis*)；

臭蟲、蚜蟲、葉蟬、粉虱、鱗翅昆蟲、蟬(半翅目(Hemiptera))，例如擬緣蝽(*Acrosternum hilare*)、麥長蝽(*Blissus leucopterus*)、煙草小盲蝽(*Cyrtopeltis notatus*)、赤星蝽(*Dysdercus cingulatus*)、棉紅蝽(*Dysdercus intermedius*)、麥扁盾蝽(*Eurygaster integriceps*)、棉蝽(*Euschistus impictiventris*)、葉足緣蝽(*Leptoglossus phyllopus*)、美國牧草盲蝽(*Lygus lineolaris*)、牧草盲蝽(*Lygus pratensis*)、稻綠蝽(*Nezara viridula*)、方背皮蝽(*Piesma quadrata*)、稻蝽(*Solubea insularis*)、紅肩蝽(*Thyanta perditor*)、紅豆蚜(*Acyrtosiphon onobrychis*)、落葉松球蚜(*Adelges laricis*)、鼠李馬鈴薯蚜(*Aphidula nasturtii*)、蠶豆蚜(*Aphis fabae*)、草莓根蚜(*Aphis forbesi*)、蘋果蚜(*Aphis pomi*)、棉蚜(*Aphis gossypii*)、茶蔗子蚜(*Aphis grossulariae*)、醋栗蚜(*Aphis schneideri*)、芹菜蚜(*Aphis spiraecola*)、接骨木蚜(*Aphis sambuci*)、豌豆蚜(*Acyrtosiphon pisum*)、馬鈴薯蚜(*Aulacorthum solani*)、銀葉粉虱(*Bemisia argentifolii*)、飛廉短尾蚜(*Brachycaudus cardui*)、光管舌尾蚜(*Brachycaudus helichrysi*)、桃黑短尾蚜(*Brachycaudus persicae*)、李短尾蚜(*Brachycaudus prunicola*)、菜蚜(*Brevicoryne brassicae*)、角釘毛蚜(*Capitophorus horni*)、棉花方翅網蝽(*Cerosipha gossypii*)、草莓毛管蚜(*Chaetosiphon fragaefolii*)、茶蔗隱瘤額蚜(*Cryptomyzus ribis*)、高加索椎

球蚜 (*Dreyfusia nordmannianae*)、雲杉椎球蚜 (*Dreyfusia piceae*)、根瘤圓尾蚜 (*Dysaphis radicola*)、擬塘鵝蚜 (*Dysaulacorthum pseudosolani*)、車前圓尾蚜 (*Dysaphis plantaginea*)、梨西圓尾蚜 (*Dysaphis pyri*)、蠶豆微葉蟬 (*Empoasca fabae*)、桃粉蚜 (*Hyalopterus pruni*)、茶藤苦菜蚜 (*Hyperomyzus lactucae*)、麥長管蚜 (*Macrosiphum avenae*)、馬鈴薯長管蚜 (*Macrosiphum euphorbiae*)、薔薇長管蚜 (*Macrosiphon rosae*)、巢菜修尾蚜 (*Megoura viciae*)、高粱蚜 (*Melanaphis pyrarius*)、麥無網長管蚜 (*Metopolophium dirhodum*)、桃蚜 (*Myzus persicae*)、冬蔥瘤額蚜 (*Myzus ascalonicus*)、櫻桃黑瘤額蚜 (*Myzus cerasi*)、桃捲葉蚜 (*Myzus varians*)、萵苣蚜 (*Nasonovia ribisnigri*)、褐稻虱 (*Nilaparvata lugens*)、萵苣根癭綿蚜 (*Pemphigus bursarius*)、甘蔗扁角飛虱 (*Perkinsiella saccharicida*)、蛇麻疣額蚜 (*Phorodon humuli*)、蘋果木虱 (*Psylla mali*)、梨木虱 (*Psylla pyri*)、冬蔥縊瘤蚜 (*Rhopalomyzus ascalonicus*)、玉米縊管蚜 (*Rhopalosiphum maidis*)、稻麥蚜 (*Rhopalosiphum padi*)、蘋果草縊管蚜 (*Rhopalosiphum insertum*)、馬拉圓尾蚜梨砧草蚜 (*Sappaphis mala*)、蘋果紅紫圓尾蚜 (*Sappaphis mali*)、麥二叉蚜 (*Schizaphis graminum*)、榆梨棉蚜 (*Schizoneura lanuginosa*)、麥長管蚜 (*Sitobion avenae*)、溫室白粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*)、橘二盆蚜 (*Toxoptera aurantii*)、葡萄根瘤蚜 (*Viteus vitifolii*)、溫帶臭蟲 (*Cimex lectularius*)、熱帶臭蟲 (*Cimex hemipterus*)、老獵椿象

蟲(*Cimex hemipterus*)、老獵椿象(*Reduvius senilis*)、錐蝽屬(*Triatoma* spp.)及輪背獵蝽(*Arilus critatus*)；

螞蟻、蜜蜂、黃蜂、鋸蜂(膜翅目(*Hymenoptera*))，例如黃翅菜葉蜂(*Athalia rosae*)、大頭切葉蟻(*Atta cephalotes*)、卡培古魯切葉蟻(*Atta capiguara*)、大頭切葉蟻(*Atta cephalotes*)、光亮切葉蟻(*Atta laevigata*)、強壯切葉蟻(*Atta robusta*)、六孔切葉蟻(*Atta sexdens*)、德州切葉蟻(*Atta texana*)、舉尾蟻屬(*Crematogaster* spp.)、李小葉蜂(*Hoplocampa minuta*)、蘋實葉蜂(*Hoplocampa testudinea*)、褐毛蟻(*Lasius niger*)、小黃家蟻(*Monomorium pharaonis*)、熱帶火蟻(*Solenopsis geminata*)、紅火蟻(*Solenopsis invicta*)、黑火蟻(*Solenopsis richteri*)、南方火蟻(*Solenopsis xyloni*)、紅收穫蟻(*Pogonomyrmex barbatus*)、加州收穫蟻(*Pogonomyrmex californicus*)、熱帶大頭家蟻(*Pheidole megacephala*)、西方蟻蜂(*Dasymutilla occidentalis*)、熊蜂屬(*Bombus* spp.)、黃胡蜂(*Vespula squamosa*)、常見黃胡蜂(*Paravespula vulgaris*)、樹黃胡蜂(*Paravespula pennsylvanica*)、德國黃胡蜂(*Paravespula germanica*)、白斑臉黃胡蜂(*Dolichovespula maculata*)、黃邊胡蜂(*Vespa crabro*)、赭色馬蜂(*Polistes rubiginosa*)、佛羅裏達弓背蟻(*Camponotus floridanus*)及阿根廷蟻(*Linepithema humile*)；

蟋蟀、蝗蟲、蚱蜢(直翅目(*Orthoptera*))，例如家蟋蟀(*Acheta domestica*)、歐洲螞蛄(*Gryllotalpa gryllotalpa*)、

飛蝗 (*Locusta migratoria*)、雙帶蚱蜢 (*Melanoplus bivittatus*)、赤腿蚱蜢 (*Melanoplus femurrubrum*)、墨西哥蚱蜢 (*Melanoplus mexicanus*)、遷徙蚱蜢 (*Melanoplus sanguinipes*)、落磯山蚱蜢 (*Melanoplus spretus*)、紅翅蝗 (*Nomadacris septemfasciata*)、南美沙漠蝗 (*Schistocerca americana*)、非洲沙漠蝗 (*Schistocerca gregaria*)、摩洛哥戟紋蝗 (*Dociostaurus maroccanus*)、溫室沙蟲 (*Tachycines asynamorus*)、塞內加爾小車蝗 (*Oedaleus senegalensis*)、臭腹腺蝗 (*Zonozelus variegatus*)、非洲蔗蝗 (*Hieroglyphus daganensis*)、印度黃檀蝗 (*Kraussaria angulifera*)、意大利蝗 (*Calliptamus italicus*)、澳洲疫蝗 (*Chortoicetes terminifera*)及南非蝗 (*Locustana pardalina*)；

蚤(蚤目 (*Siphonaptera*))，例如貓櫛頭蚤 (*Ctenocephalides felis*)、犬櫛頭蚤 (*Ctenocephalides canis*)、印鼠客蚤 (*Xenopsylla cheopis*)、人蚤 (*Pulex irritans*)、穿皮潛蚤 (*Tunga penetrans*)及具帶病蚤 (*Nosopsyllus fasciatus*)，

衣魚 (silverfish)、家衣魚 (firebrat)(纓尾目 (*Thysanura*))，例如衣魚 (*Lepisma saccharina*)及斑衣魚 (*Thermobia domestica*)，

唇足類 (centipedes)(唇足亞綱 (*Chilopoda*))，例如蚰蜒 (*Scutigera coleoptrata*)，

千足蟲 (倍足綱 (*Diplopoda*))，例如鉤蟲屬 (*Narceus* spp.)，

蠼螋 (Earwigs)(革翅目 (*Dermaptera*))，例如歐洲球蠼

(forficula auricularia) ,

虱(虱毛目(Phthiraptera)) , 例如頭蝨(Pediculus humanus capitis) 、 體虱(Pediculus humanus corporis) 、 恥陰虱(Pthirus pubis) 、 牛血虱(Haematopinus eurysternus) 、 豬血虱(Haematopinus suis) 、 牛顎虱(Linognathus vituli) , 牛毛虱(Bovicola bovis) 、 雞短角羽虱(Menopon gallinae) 、 雞體虱(Menacanthus stramineus) 及水牛盲虱(Solenopotes capillatus) ,

彈尾目(Collembola)(跳蟲) , 例如棘跳蟲亞種(Onychiurus ssp.) 。

本發明化合物(包括其鹽、立體異構體及互變異構體)尤其可用於製昆蟲、較佳吮吸或刺穿昆蟲, 例如來自纓翅目類、雙翅目類及半翅目類之昆蟲, 尤其以下屬:

纓翅目: 蘭花薊馬、褐花薊馬、西花薊馬、東方花卉薊馬、柑桔薊馬、稻薊馬、南黃薊馬及棉薊馬。

雙翅目, 例如埃及伊蚊、白紋伊蚊、刺擾伊蚊、墨西哥果實蠅、五斑按蚊、災難按蚊、淡色按蚊、岡比亞按蚊、泛生按蚊、白踝按蚊、微小按蚊、四斑按蚊、紅頭麗蠅、地中海果實蠅、蛆症金蠅、螺旋金蠅、腐敗錐蠅、中室斑虻、靜斑虻、大西洋斑虻、螺旋蠅、高粱癭蚊、嗜人瘤蠅、毛庫蠓、尖音庫蚊、黑須庫蚊、致倦庫蚊、跗斑庫蚊、純色脈毛蚊、黑尾脈毛蚊、瓜實蠅、油橄欖實蠅、芸苔莢癭蚊、蔥地種蠅、麥地種蠅、灰地種蠅、甘藍地種蠅、人膚蠅、黃腹廁蠅、三點禾蠅、馬腸胃蠅、刺舌蠅、

須舌蠅、引舌蠅、膠舌蠅、東方臂蠅、桃紅癭蚊、潛蠅屬、種蠅、紋皮蠅、急流細蠓、蔬菜斑潛蠅、非洲菊斑潛蠅、羊綠蠅、銅綠蠅、絲光綠蠅、寡毛蠅、曼蚊、黑森癭蚊、秋家蠅、家蠅、廢腐蠅、羊鼻蠅、禾蠅、瑞典麥桿蠅、甜菜潛葉蠅、蔥蠅、甘藍種蠅、麥種蠅、銀足白蛉、哥倫比亞鱗蚊、胡蘿蔔莖蠅、異色鱗蚊、混合墨蚊、櫻桃實蠅、蘋果實蠅、紅尾肉蠅、肉蠅屬、帶蚋、廢刺蠅、牛虻、黑虻、具條牛虻及擬原虻、沼澤大蚊及歐洲大蚊；

半翅目(具體而言蚜蟲)：紅豆蚜、落葉松球蚜、鼠李馬鈴薯蚜、蠶豆蚜、草莓根蚜、蘋果蚜、棉蚜、茶蔗子蚜、醋栗蚜、芹菜蚜、接骨木蚜、豌豆蚜、馬鈴薯蚜、飛廉短尾蚜、光管舌尾蚜、桃黑短尾蚜、李短尾蚜、菜蚜、角釘毛蚜、棉花方翅網蝽、草莓毛管蚜、茶蔗隱瘤額蚜、高加索椎球蚜、雲杉椎球蚜、根瘤圓尾蚜、擬塘鵝蚜、車前圓尾蚜、梨西圓尾蚜、蠶豆微葉蟬、桃粉蚜、茶藤苦菜蚜、麥長管蚜、馬鈴薯長管蚜、薔薇長管蚜、巢菜修尾蚜、高粱蚜、麥無網長管蚜、桃蚜、冬蔥瘤額蚜、櫻桃黑瘤額蚜、桃蚜、桃捲葉蚜、蒿苳蚜、褐稻虱、蒿苳根癭綿蚜、甘蔗扁角飛虱、蛇麻疣額蚜、蘋木虱、梨木虱、冬蔥縊瘤蚜、玉米縊管蚜、稻麥蚜、蘋草縊管蚜、馬拉圓尾蚜、蘋紅紫圓尾蚜、麥二叉蚜、榆梨棉蚜、麥長管蚜、白背飛虱、溫室白粉虱、橘蚜及葡萄根瘤蚜。

本發明化合物(包括其鹽、立體異構體及互變異構體)尤其可用於控制半翅目及縊翅目昆蟲。

本發明進一步提供用於防治無脊椎害蟲之農業組合物，其包含此量之至少一種本發明化合物及至少一種具有殺蟲作用之惰性液體及/或固體農藝學上可接受之載劑，及若需要至少一種表面活性劑。

此組合物可包含單一本發明活性化合物或數種本發明活性化合物之混合物。本發明組合物可包含個別異構體或異構體混合物或鹽以及個別互變異構體或互變異構體混合物。

可借助噴霧、霧化、撒施、播撒或傾施以原狀態、以其調配物形式或自其製備之使用形式使用本發明混合物，例如以下列形式使用：可直接噴霧之溶液、粉劑、懸浮液或分散液、乳液、油分散液、膏糊、可撒施產品、播撒用材料或顆粒。使用形式完全取決於既定用途；意欲使其確保在每一情形下本發明活性化合物皆能盡可能最精細地分佈。

調配物係以已知方式製備(關於綜述參見(例如)US 3,060,084；EP-A 707 445 (針對液體濃縮物)；Browning, 「Agglomeration」, Chemical Engineering, 1967年12月4日, 147-48；Perry之Chemical Engineer's Handbook, 第4版, McGraw-Hill, New York, 1963, 第8頁至第57頁以及下列等：WO 91/13546；US 4,172,714；US 4,144,050；US 3,920,442；US 5,180,587；US 5,232,701；US 5,208,030；GB 2,095,558；US 3,299,566；Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons公司, New York, 1961；

Hance 等人，Weed Control Handbook，第8版，Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 及 Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Germany), 2001, 2；D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998，例如向活性化合物中摻入適用於農業化學品調配之助劑，例如溶劑及/或載劑，若需要乳化劑、表面活性劑及分散劑、防腐劑、消泡劑、防凍劑，對於種子處理調配物而言，亦視情況摻入著色劑及/或黏合劑及/或膠凝劑。

適宜之溶劑/載劑係(例如)：

- 溶劑例如水、芳族溶劑(例如芳烴油溶劑產物、二甲苯及諸如此類)、石蠟(例如礦物餾分)、醇(例如甲醇、丁醇、戊醇、苜醇)、酮(例如環己酮、 γ -丁內酯)、吡咯啉酮(N-甲基-吡咯啉酮(NMP)、N-辛基吡咯啉酮NOP)、乙酸酯(乙二醇二乙酸酯)、乳酸烷基酯、內酯(例如 γ -丁內酯)、二醇、脂肪酸二甲基鹽胺、脂肪酸及脂肪酸酯、三酸甘油酯、植物或動物來源之油及改良油(例如烷基化植物油)。

原則上，亦可使用溶劑混合物。

- 載劑，例如經研磨天然礦物及經研磨合成礦物，例如矽膠、細緻矽酸、矽酸鹽、滑石粉、高嶺土、鎂質黏土、石灰岩、石灰、白堊、紅玄武土、黃土、黏土、白雲石、矽藻土、硫酸鈣及硫酸鎂、氧化鎂、經研磨合成材料；肥料，例如，硫酸銨、磷酸銨、硝酸銨、尿素；及植物來源

產品，例如穀類粗粉、樹皮粗粉、木粉及堅果殼粉；纖維素粉末及其他固體載劑。

適宜乳化劑係非離子型及陰離子型乳化劑(例如聚氧乙烯脂肪醇醚、烷基磺酸鹽及芳基磺酸鹽)。

分散劑之實例為木素-亞硫酸鹽廢液及甲基纖維素。

適宜表面活性劑係木質素磺酸、萘磺酸、酚磺酸、二丁基萘磺酸、烷基芳基磺酸酯、硫酸烷酯、磺酸烷酯、脂肪醇硫酸酯、脂肪酸及硫酸化脂肪醇乙二醇醚之鹼金屬、鹼土金屬及銨鹽，以及磺酸化萘及萘衍生物與甲醛之縮合物、萘或萘磺酸與苯酚及甲醛之縮合物、聚環氧乙烷辛基苯酚醚、乙氧基化異辛基苯酚、辛基苯酚、壬基苯酚、烷基苯基聚乙二醇醚、三丁苯基聚乙二醇醚、三硬脂基苯基聚乙二醇醚、烷基芳基聚醚醇、醇及脂肪醇/環氧乙烷縮合物、乙氧基化蓖麻油、聚環氧乙烷烷基醚、乙氧基化聚環氧丙烷、月桂醇聚乙二醇醚縮醛、山梨醇酯。

亦可將諸如甘油、乙二醇、丙二醇等防凍劑及殺細菌劑加入調配物中。

適宜消泡劑係(例如)基於硬脂酸矽或硬脂酸鎂之消泡劑。

適宜防腐劑係(例如)二氯芬(dichlorophen)及苜醇半縮甲醛。

適宜增稠劑係賦予調配物假塑性流動行為(即靜止時為高黏度且在攪拌階段為低黏度)之化合物。在此背景下，可提及者係(例如)基於聚糖之市售增稠劑，例如 Xanthan

Gum® (購自 Kelco 之 Kelzan®)、Rhodopol®23 (Rhône Poulenc)或 Veegum® (購自 R.T. Vanderbilt)或有機層狀矽酸鹽，例如 Attaclay® (購自 Engelhardt)。適用於本發明分散液之消泡劑係(例如)聚矽氧乳液(例如，購自 Rhodia 之 Silikon® SRE、Wacker 或 Rhodorsil®)、長鏈醇、脂肪酸、有機氟化合物及其混合物。可添加殺生物劑以穩定本發明組合物以抵抗微生物侵襲。適宜殺生物劑係(例如)基於異噻唑酮，例如由 Avecia (或 Arch)以商標 Proxel®或由 Thor Chemie 以 Acticide® RS 及由 Rohm & Haas 以 Kathon® MK 出售之化合物。適宜防凍劑係有機二醇，例如乙二醇、丙二醇或甘油。此等物質以活性化合物組合物總量計通常以不超過10重量%之量使用。若適宜，本發明活性化合物組合物以所製備調配物總量計可包含1重量%至5重量%緩衝劑以調節 pH，所用緩衝劑之量及類型視活性化合物之化學性質而定。緩衝劑之實例係弱無機或有機酸(例如磷酸、硼酸、乙酸、丙酸、檸檬酸、富馬酸、酒石酸、草酸及琥珀酸)之鹼金屬鹽。

適於製備可直接噴霧溶液、乳液、膏糊或油分散液之物質係具中至高沸點之礦物油餾分，例如煤油或柴油；以及煤焦油及植物或動物來源之油；脂肪烴、環烴及芳烴，例如甲苯、二甲苯、石蠟、四氫化萘、烷基化萘或其衍生物；甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、環己醇、環己酮、異佛爾酮；強極性溶劑，例如二甲基亞砷、N-甲基吡咯啉酮及水。

粉劑、播撒用材料及可撒施產品可藉由混合或同時研磨活性物質與固體載劑來製備。

可藉由使活性化合物與固體載劑結合來製備顆粒，例如經塗覆顆粒、經浸漬顆粒及均勻顆粒。固體載劑之實例係礦物土，例如矽膠、矽酸鹽、滑石粉、高嶺土、鎂質黏土、石灰石、石灰、白堊、紅玄武土、黃土、黏土、白雲石、矽藻土、硫酸鈣、硫酸鎂、氧化鎂，經研磨合成材料；肥料，例如硫酸銨、磷酸銨、硝酸銨、尿素；及植物來源產品，例如穀類粗粉、樹皮粗粉、木粉及堅果殼粉；纖維素粉末及其他固體載劑。

一般而言，調配物(即，本發明組合物)包含0.01重量%至95重量%、較佳0.1重量%至90重量%活性成份。所用活性成份之純度為90%至100%、較佳95%至100%(根據NMR譜)。

出於種子處理目的，可將各調配物稀釋2至10倍以使即用製劑中活性化合物之重量比濃度介於0.01-60重量%之間，較佳介於0.1-40重量%之間。

以下係調配物實例：

1.用水稀釋之產品。對於種子處理目的，可將經稀釋或未經稀釋之該等產品施加至種子上。

A) 水溶性濃縮物(SL, LS)

將10重量份數活性化合物溶於90重量份數水或水溶性溶劑中。作為替代方案，可添加潤濕劑或其他輔助劑。在用水稀釋後，活性化合物溶解，藉此獲得具有10% (w/w)活

性化合物之調配物。

B) 可分散濃縮物(DC)

將20重量份數活性化合物溶於70重量份數環己酮中，並添加10重量份數分散劑(例如聚乙烷基吡咯啉酮)。用水稀釋得到分散液，藉此獲得具有20% (w/w)活性化合物之調配物。

C) 可乳化濃縮物(EC)

將15重量份數活性化合物溶於7重量份數二甲苯中，並添加十二烷基苯磺酸鈣及乙氧基化蓖麻油(在每一情形下皆為5重量份數)。用水稀釋得到乳液，藉此獲得具有15% (w/w)活性化合物之調配物。

D) 乳液(EW, EO, ES)

將25重量份數活性化合物溶於35重量份數二甲苯中，並添加十二烷基苯磺酸鈣及乙氧基化蓖麻油(在每一情形下皆為5重量份數)。借助乳化機(例如Ultraturrax)將此混合物引入30重量份數水中並將其製成均質乳液。用水稀釋得到乳液，藉此獲得具有25% (w/w)活性化合物之調配物。

E) 懸浮液(SC, OD, FS)

在攪拌式球磨機中，粉碎20重量份數活性化合物，並添加10重量份數分散劑、潤濕劑及70重量份數水或有機溶劑，得到細緻活性化合物懸浮液。用水稀釋，得到活性化合物之穩定懸浮液，藉此獲得含20% (w/w)活性化合物之調配物。

F) 水可分散顆粒及水溶性顆粒(WG, SG)

將50重量份數活性化合物細緻研磨，並添加50重量份數分散劑及潤濕劑並借助機械設備(例如擠出機、噴霧塔、流化床)製成水可分散或水溶性顆粒。用水稀釋，得到活性化合物之穩定分散液或溶液，藉此獲得含50% (w/w)活性化合物之調配物。

G) 水可分散粉末及水溶性粉末(WP, SP, SS, WS)

在轉子-定子磨機中研磨75重量份數活性化合物，並添加25重量份數分散劑、潤濕劑及矽膠。用水稀釋，得到活性化合物之穩定分散液或溶液，藉此獲得具有75% (w/w)活性化合物之調配物。

H) 凝膠調配物(GF)

在攪拌式球磨機中，將20重量份數活性化合物粉碎，並添加10重量份數分散劑、1重量份數膠凝劑潤濕劑及70重量份數水或有機溶劑，得到精細活性化合物懸浮液。用水稀釋，得到活性化合物之穩定懸浮液，藉此獲得具有20% (w/w)活性化合物之調配物。

2. 無需稀釋即可施加之葉片用產品。對於種子處理目的，可將經稀釋或未經稀釋之該等產品施加至種子上。

I) 可施撒粉末(DP, DS)

精細研磨5重量份數活性化合物並與95重量份數細緻高嶺土充分混合。藉此得到具有5% (w/w)活性化合物之可撒施產品。

J) 顆粒(GR, FG, GG, MG)

精細研磨0.5重量份數活性化合物並與95.5重量份數載劑

聯合，藉此獲得具有0.5% (w/w)活性化合物之調配物。現行方法係擠出、噴霧乾燥或流化床。藉此得到不經稀釋即可施加之葉片用顆粒。

K) ULV溶液(UL)

將10重量份數活性化合物溶於90重量份數有機溶劑(例如二甲苯)中。藉此得到具有10% (w/w)活性化合物之產品，其不經稀釋即可用於葉片施加。

可藉由添加水自乳液濃縮物、膏糊或可濕性粉劑(可噴霧粉劑、油分散液)來製備水性使用形式。為製備乳液、膏或油分散液，可在水中藉助潤濕劑、增黏劑、分散劑或乳化劑使該等物質以原樣或溶於油或溶劑中之形式均質化。另一選擇為，可製備由活性物質、潤濕劑、增黏劑、分散劑或乳化劑及(若適當)溶劑或油構成之濃縮物，且該等濃縮物適於用水稀釋。

即用產品中活性成份之濃度可在相對寬範圍內變化。一般而言，該等濃度為0.0001%至10%、較佳0.01%至1%。

活性成份亦可成功地用於超低量方法(ULV)中，可施加包含超過95重量%活性成份之調配物，或甚至可施加不含添加劑之活性成份。

在本發明之方法及用途中，本發明化合物可與其他活性成份一起使用，例如與其他殺蟲劑、殺昆蟲劑、除草劑、肥料(例如硝酸銨、尿素、鉀鹼及過磷酸鹽)、植物毒素及植物生長調節劑、安全劑及殺線蟲劑一起使用。此等額外成份可依序使用或與上述組合物組合使用，若適宜，其亦

可在即將使用前添加(罐混合)。舉例而言，可在用其他活性成份處理之前或之後用本發明組合物噴霧植物。

以下列表M展示可與本發明化合物一起使用且使用其可產生潛在協同效應之殺蟲劑，該列表意欲闡釋可能的組合，但不施加任何限制：

M.1.有機(硫)磷酸鹽化合物：歐殺松(acephate)、亞滅松(azamethiphos)、益棉磷(azinphos-ethyl)、穀速松(azinphos-methyl)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、氯芬松(chlorfenvinphos)、氯甲磷(chlormephos)、陶斯松(chlorpyrifos)、甲基陶斯松(chlorpyrifos-methyl)、蠅毒磷(coumaphos)、氰乃松(cyanophos)、滅賜松(demeton-S-methyl)、大利松(diazinon)、二氯松(dichlorvos)/ DDVP、雙特松(dicrotophos)、大滅松(dimethoate)、甲基毒蟲畏(dimethylvinphos)、二硫松(disulfoton)、EPN、愛殺松(ethion)、普伏松(ethoprophos)、胺磺磷(famphur)、芬滅松(fenamiphos)、撲滅松(fenitrothion)、芬殺松(fenthion)、吡氟硫磷(flupyrzophos)、福賽絕(fosthiazate)、飛達松(heptenophos)、加福松(isoxathion)、馬拉松(malathion)、滅加松(mecarbam)、達馬松(methamidophos)、滅大松(methidathion)、美文松(mevinphos)、亞素靈(monocrotophos)、乃力松(naled)、毆滅松(omethoate)、滅多松(oxydemeton-methyl)、巴拉松(parathion)、甲基巴拉松(parathion-methyl)、賽達松(phenthoate)、福瑞松(phorate)、裕必松(phosalone)、益滅

松 (phosmet) 、 福 賜 米 松 (phosphamidon) 、 巴 賽 松 (phoxim) 、 亞 特 松 (pirimiphos-methyl) 、 佈 飛 松 (profenofos) 、 胺 丙 畏 (propetamphos) 、 普 硫 松 (prothiofos) 、 白 克 松 (pyraclofos) 、 必 芬 松 (pyridaphenthion) 、 拜 裕 松 (quinalphos) 、 治 螟 磷 (sulfotep) 、 丁 基 嘧 啶 磷 (tebupirimfos) 、 亞 培 松 (temephos) 、 託 福 松 (terbufos) 、 樂 本 松 (tetrachlorvinphos) 、 硫 滅 松 (thiometon) 、 三 落 松 (triazophos) 、 三 氯 松 (trichlorfon) 、 繁 米 松 (vamidothion) ;

M.2. 胺 基 甲 酸 酯 化 合 物 : 得 滅 克 (aldicarb) 、 棉 鈴 威 (alanycarb) 、 免 敵 克 (bendiocarb) 、 免 扶 克 (benfuracarb) 、 佈 嘉 信 (butocarboxim) 、 丁 酮 磯 威 (butoxycarboxim) 、 加 保 利 (carbaryl) 、 加 保 扶 (carbofuran) 、 丁 基 加 保 扶 (carbosulfan) 、 愛 芬 克 (ethiofencarb) 、 丁 基 滅 必 蝨 (fenobucarb) 、 覆 滅 蟎 (formetanate) 、 呋 線 威 (furathiocarb) 、 滅 必 蝨 (isoprocarb) 、 滅 賜 克 (methiocarb) 、 納 乃 得 (methomyl) 、 治 滅 蝨 (metolcarb) 、 毆 殺 滅 (oxamyl) 、 比 加 普 (pirimicarb) 、 安 丹 (propoxur) 、 硫 敵 克 (thiodicarb) 、 硫 伐 隆 (thiofanox) 、 混 殺 威 (trimethacarb) 、 XMC 、 滅 爾 蝨 (xylylcarb) 、 唑 蚜 威 (triazamate) ;

M.3. 擬 除 蟲 菊 酯 化 合 物 : 阿 納 寧 (acrinathrin) 、 亞 烈 寧 (allethrin) 、 右 旋 - 順 - 反 亞 烈 寧 、 右 旋 - 反 亞 烈 寧 、 畢 芬 寧 (bifenthrin) 、 百 亞 列 寧 (bioallethrin) 、 S-環 戊 烯 基 百 亞 列

寧、百列滅寧(bioresmethrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、 β -賽扶寧、賽洛寧(cyhalothrin)、 λ -賽洛寧、 γ -賽洛寧、賽滅寧(cypermethrin)、 α -賽滅寧、 β -賽滅寧、 θ -賽滅寧、 ζ -賽滅寧、賽酚寧(cyphenothrin)、第滅寧(deltamethrin)、益避寧(empenthrin)、益化利(esfenvalerate)、依芬寧(etofenprox)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、護賽寧(flucythrinate)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、福化利(tau-fluvalinate)、合芬寧(halfenprox)、依普寧(imiprothrin)、甲氧苄氟菊酯(metofluthrin)、百滅寧(permethrin)、苯氧司林(phenothrin)、普亞烈寧(prallethrin)、丙氟菊酯(profluthrin)、除蟲菊精(pyrethrin, pyrethrum)、列滅寧(resmethrin)、矽護芬(silafluofen)、汰福寧(tefluthrin)、胺菊酯(tetramethrin)、泰滅寧(tralomethrin)、拜富寧(transfluthrin)；

M.4.保幼激素模擬物：烯蟲乙酯(hydroprene)、烯蟲炔酯(kinoprene)、美賜平(methoprene)、芬諾克(fenoxycarb)及百利普芬(pyriproxyfen)；

M.5.菸鹼受體激動劑/拮抗劑化合物：亞滅培(acetamiprid)、免速達(bensultap)、培丹(cartap hydrochloride)、可尼丁(clothianidin)、達特南(dinotefuran)、益達胺(imidacloprid)、賽速安(thiamethoxam)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、尼古丁(nicotine)、賜諾殺(spinosad)(變構性激動劑)、賜諾特

(spinetoram)(變構性激動劑)、賽果培(thiacloprid)、硫賜安(thiocyclam)、殺蟲雙(thiosultap-sodium)及AKD1022；

M.6.GABA 閘控氯離子通道拮抗劑化合物：氯丹(chlordane)、安殺番(endosulfan)、 γ -HCH (靈丹(lindane)); 益斯普(ethiprole)、芬普尼(fipronil)、吡嗪氟蟲腈(pyrafluprole)、吡啶氟蟲腈(pyriprol)；

M.7.氯離子通道激活劑：阿巴汀(abamectin)、因滅汀(emamectin benzoate)、密滅汀(milbemectin)及雷皮菌素(lepimectin)；

M.8.METI I 化合物：芬殺蟎(fenazaquin)、芬普蟎(fenpyroximate)、畢汰芬(pyrimidifen)、畢達本(pyridaben)、得芬瑞(tebufenpyrad)、脫芬瑞(tolfenpyrad)、嘯蟲胺(flufenimer)、魚藤精(rotenone)；

M.9.METI II及III化合物：亞醌蟎(acequinocyl)、氟瑞姆(fluacyprim)及愛美松(hydramethylnon)；

M.10.氧化磷酸化之解偶聯劑：克凡派(chlorfenapyr)、DNOC；

M.11.氧化磷酸化抑制劑：亞環錫(azocyclotin)、錫滿丹(cyhexatin)、汰芬隆(diafenthiuron)、芬布賜(fenbutatin oxide)、毆蟎多(propargite)及得脫蟎(tetradifon)；

M.12.賽滅淨(cyromazine)、可芬諾(chromafenozide)、合芬隆(halofenozide)、滅芬諾(methoxyfenozide)、得芬諾(tebufenozide)；

M.13.協力劑：胡椒基丁醚(piperonyl butoxide)、脫葉磷

(tribufos)；

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

M.15. 薰蒸劑：甲基溴、氯化苦磺醯氟(chloropicrin sulfuryl fluoride)；

M.16. 選擇性飼餵阻斷劑：氟鋁酸鈉(cryotie)、派滅淨(pymetrozine)、氟尼胺(flonicamid)；

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

M.18. 幾丁質合成抑制劑：布芬淨(buprofezin)、雙三氟蟲脲(bistrifluron)、克福隆(chlorfluazuron)、二福隆(diflubenzuron)、氟環脲(flucycloxuron)、氟芬隆(flufenoxuron)、六伏隆(hexaflumuron)、祿芬隆(lufenuron)、諾伐隆(novaluron)、諾福隆(noviflumuron)、得福隆(teflubenzuron)及殺蟲隆(triflumuron)；

M.19. 脂質生物合成抑制劑：賜派芬(spirodiclofen)、螺甲蟎酯(spiromesifen)、賜派滅(spirotetramat)；

M.20. 八胺能激動劑：三亞蟎(amitraz)；

M.21. 蘭尼鹼(ryanodine)受體調節劑：氟大滅(flubendiamide)及鄰苯二甲醯胺化合物(R)-, (S)-3-氯-N1-{2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基}-N2-(1-甲基-2-甲基磺醯基乙基)鄰苯二甲醯胺(M21.1)；

M.22. 異噁唑啉化合物：4-[5-(3,5-二氯-苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫-異噁唑-3-基]-2-甲基-N-吡啶-2-基甲基-苯甲醯

胺(M22.1)、4-[5-(3,5-二氯-苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫-異噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2,2,2-三氟-乙基)-苯甲醯胺(M22.2)、4-[5-(3,5-二氯-苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫-異噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(2,2,2-三氟-乙基胺甲醯基)-甲基]-苯甲醯胺(M22.3)、4-[5-(3,5-二氯-苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫-異噁唑-3-基]-萘-1-甲酸[(2,2,2-三氟-乙基胺甲醯基)-甲基]-醯胺(M22.4)、4-[5-(3,5-二氯-苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫-異噁唑-3-基]-N-[(甲氧基亞胺基)甲基]-2-甲基苯甲醯胺(M22.5)、4-[5-(3-氯-5-三氟甲基-苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫-異噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(2,2,2-三氟-乙基胺甲醯基)-甲基]-苯甲醯胺(M22.6)、4-[5-(3-氯-5-三氟甲基-苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫-異噁唑-3-基]-萘-1-甲酸[(2,2,2-三氟-乙基胺甲醯基)-甲基]-醯胺(M22.7)及5-[5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫-異噁唑-3-基]-2-[1,2,4]三唑-1-基-苄腈(M22.8)；

M.23. 鄰胺基苯甲醯胺化合物：剋安勃(chlorantraniliprole)、氰蟲醯胺(cyantraniliprole)、5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[4-氰基-2-(1-環丙基-乙基胺甲醯基)-6-甲基-苯基]-醯胺(M23.1)、5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[2-氯-4-氰基-6-(1-環丙基-乙基胺甲醯基)-苯基]-醯胺(M23.2)、5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[2-溴-4-氰基-6-(1-環丙基-乙基胺甲醯基)-苯基]-醯胺(M23.3)、5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡唑-3-甲酸[2-溴-4-氯-6-(1-環丙基-乙基胺甲醯基)-苯基]-醯胺

(M23.4)、5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-甲酸[2,4-二氯-6-(1-環丙基-乙基胺甲鹽基)-苯基]-醯胺(M23.5)、5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-甲酸[4-氯-2-(1-環丙基-乙基胺甲鹽基)-6-甲基-苯基]-醯胺(M23.6)、N'-(2-{[5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-羰基]-胺基}-5-氯-3-甲基-苯甲鹽基)-肼甲酸甲基酯(M23.7)、N'-(2-{[5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-羰基]-胺基}-5-氯-3-甲基-苯甲鹽基)-N'-甲基-肼甲酸甲基酯(M23.8)、N'-(2-{[5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-羰基]-胺基}-5-氯-3-甲基-苯甲鹽基)-N,N'-二甲基-肼甲酸甲基酯(M23.9)、N'-(3,5-二溴-2-{[5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-羰基]-胺基}-苯甲鹽基)-肼甲酸甲基酯(M23.10)、N'-(3,5-二溴-2-{[5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-羰基]-胺基}-苯甲鹽基)-N'-甲基-肼甲酸甲基酯(M23.11)及N'-(3,5-二溴-2-{[5-溴-2-(3-氯-吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-羰基]-胺基}-苯甲鹽基)-N,N'-二甲基-肼甲酸甲基酯(M23.12)；

M.24. 丙二腈化合物：2-(2,2,3,3,4,4,5,5-八氟戊基)-2-(3,3,3-三氟-丙基)丙二腈($\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$)(M24.1)及2-(2,2,3,3,4,4,5,5-八氟戊基)-2-(3,3,4,4,4-五氟丁基)-二氟甲烷($\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{-CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$)(M24.2)；

M.25. 微生物干擾劑：蘇雲金芽孢桿菌以色列亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *Israelensi*)、球形桿菌(*Bacillus sphaericus*)、蘇雲金芽孢桿菌鯰澤亞種(*Bacillus*

thuringiensis subsp. Aizawai)、蘇雲金芽孢桿菌庫斯克亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *Kurstaki*)、蘇雲金芽孢桿菌擬步行甲亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *Tenebrionis*)；

M.26.胺基呋喃酮化合物：4-{[(6-溴吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M26.1)、4-{[(6-氟吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M26.2)、4-{[(2-氯1,3-噻唑并-5-基)甲基](2-氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M26.3)、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M26.4)、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M26.5)、4-{[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](甲基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M26.6)、4-{[(5,6-二氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M26.7)、4-{[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](環丙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M26.8)、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](環丙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M26.9)及4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](甲基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(M26.10)；

M.27.各種化合物：好達勝(aluminium phosphide)、磺胺蟎酯(amidoflumet)、異噻蟲啉(benclothiaz)、西脫蟎(benzoximate)、必芬蟎(bifenazate)、硼砂(borax)、新殺蟎(bromopropylate)、氰化物、苯腈吡蟎酯(cyenopyrafen)、賽芬蟎(cyflumetofen)、滅蟎猛(chinomethionate)、大克蟎(dicofol)、氟乙酸酯、磷、吡蟲丙醚(pyridalyl)、氟蟲吡啶(pyrifluquinazon)、硫黃、有機硫化合物、吐酒石(tartar

emetic)、氟啞蟲胺脒(sulfoxaflor)、N-R'-2,2-二鹵-1-R''環丙烷甲醯胺-2-(2,6-二氯- α,α,α -三氟-對-甲苯基)脒或N-R'-2,2-二(R''')丙醯胺-2-(2,6-二氯- α,α,α -三氟-對-甲苯基)-脒(其中R'係甲基、乙基,鹵基係氯或溴,R''係氫或甲基且R'''係甲基或乙基),4-丁-2-炔基氧基-6-(3,5-二甲基-六氫吡啶-1-基)-2-氯-嘓啞(M27.1)、環丙烷乙酸、1,1'-[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-4-[(2-環丙基乙醯基)氧基]甲基]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氫-12-羥基-4,6a,12b-三甲基-11-側氧基-9-(3-吡啞基)-2H,11H-萘并[2,1-b]吡喃并[3,4-e]吡喃-3,6-二基]酯(M27.2)及8-(2-環丙基甲氧基-4-三氟甲基-苯氧基)-3-(6-三氟甲基-嗒咩-3-基)-3-氮雜-二環[3.2.1]辛烷(M27.3)。

群組M之市售化合物可參見Pesticide Manual,第13版, British Crop Protection Council (2003)以及其他出版物。

對氧磷(Paraoxon)及其製備已闡述於Farm Chemicals Handbook,第88卷,Meister出版公司,2001。吡氟硫磷(Flupyrzofos)已闡述於Pesticide Science 54,1988,第237頁至第243頁及US 4822779中。AKD 1022及其製備已闡述於US 6300348中。M21.1係自WO 2007/101540獲知。異噁唑啉M22.1至M22.8已闡述於(例如)WO 2005/085216、WO 2007/079162、WO 2007/026965、WO 2009/126668及WO 2009/051956中。鄰胺基苯甲醯胺M23.1至M23.6已闡述於WO 2008/72743及WO 200872783中,彼等M23.7至M23.12已闡述於WO 2007/043677中。丙二脒M24.1及

M24.2 已闡述於 WO 02/089579、WO 02/090320、WO 02/090321、WO 04/006677、WO 05/068423、WO 05/068432 及 WO 05/063694 中。M26.1 至 M6.10 已闡述於(例如)WO 2007/115644 中。M27.1 闡述於(例如)JP 2006131529 中。有機硫化合物已闡述於 WO 2007060839 中。M27.2 已闡述於 WO 2008/ 66153 及 WO 2008/108491 中。M27.3 已闡述於 JP 2008/115155 中。

可結合本發明化合物使用之以下活性物質列表 F 意欲闡釋可能之組合但不限於該等組合：

F.I)呼吸抑制劑

F.I-1)Qo 位置錯合物 III 抑制劑(例如嗜毬果傘素類(strobilurins))

嗜毬果傘素類：亞托敏(azoxystrobin)、甲香菌酯(coumethoxystrobin)、丁香菌酯(coumoxystrobin)、醚菌胺(dimoxystrobin)、烯肟菌酯(enestroburin)、氟嘧菌酯(fluxastrobin)、克收欣(kresoxim-methyl)、苯氧菌胺(metominostrobin)、肟醚菌胺(orysastrobin)、啉氧菌酯(picoxystrobin)、百克敏(pyraclostrobin)、唑胺菌酯(pyrametostrobin)、唑菌酯(pyraoxystrobin)、吡菌苯威(pyribencarb)、三氯吡卡(triclopyricarb)/氯啉卡(chlorodincarb)、三氟敏(trifloxystrobin)、2-[2-(2,5-二甲基-苯氧基甲基)-苯基]-3-甲氧基-丙烯酸甲基酯及 2 (2-(3-(2,6-二氯苯基)-1-甲基-亞烯丙基胺基氧基甲基)-苯基)-2-甲氧基亞胺基-N 甲基-乙醯胺；

噁唑烷二酮類及咪唑啉酮類：凡殺同(famoxadone)、咪唑菌酮(fenamidone)；

F.I-2)錯合物II抑制劑(例如甲醯胺類)：

甲醯胺苯胺類：麥鏽靈(benodanil)、聯苯吡菌胺(bixafen)、白克列(boscalid)、萎鏽靈(carboxin)、甲呋醯胺(fenfuram)、環醯菌胺(fenhexamid)、氟吡菌醯胺(fluopyram)、福多寧(flutolanil)、福拉比(furametpyr)、吡唑茶菌胺(isopyrazam)、亞汰尼(isotianil)、滅普寧(mepronil)、嘉保信(oxycarboxin)、戊苯吡菌胺(penflufen)、吡噻菌胺(penthiopyrad)、環丙吡菌胺(sedaxane)、克枯爛(tecloftalam)、賽氟滅(thifluzamide)、噻醯菌胺(tiadinil)、2-胺基-4-甲基-噁唑-5-甲醯胺、N-(3',4',5'-三氟聯苯-2基)-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、N-(4'-三氟甲硫基聯苯-2-基)-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺及N-(2-(1,3,3-三甲基-丁基)-苯基)-1,3-二甲基-5-氟-1H-吡唑-4-甲醯胺；

F.I-3)Qi位置錯合物III抑制劑：賽座滅(cyazofamid)、安美速(amisulbrom)；

F.I-4)其他呼吸抑制劑(錯合物I，解偶聯劑)

二氟林(diflumetorim)；四氯硝基苯(tecnazen)；富米綜(ferimzone)；辛唑嘧菌胺(ametoctradin)；矽噻菌胺(silthiofam)；

硝基苯基衍生物：百蟊克(binapacryl)、大脫蟊(dinobuton)、白粉克(dinocap)、扶吉胺(fluzinam)、酞菌

酯 (nitrthal-isopropyl) ,

有機金屬化合物：三苯錫鹽，例如三苯醋錫 (fentin-acetate)、三苯氯錫 (fentin chloride) 或三苯羥錫 (fentin hydroxide) ;

F.II) 固醇生物合成抑制劑 (SBI 殺真菌劑)

F.II-1) C14 脫甲基酶抑制劑 (DMI 殺真菌劑，例如三唑類、咪唑類)

三唑類：阿紫康唑 (azaconazole)、比多農 (bitertanol)、溴克座 (bromuconazole)、環克座 (cyproconazole)、待克利 (difenoconazole)、烯唑醇 (diniconazole)、達克利 (diniconazole-M)、依普座 (epoxiconazole)、芬克座 (fenbuconazole)、氟喹唑 (fluquinconazole)、護矽得 (flusilazole)、護汰芬 (flutriafol)、菲克利 (hexaconazole)、易胺座 (imibenconazole)、種菌唑 (ipconazole)、滅特座 (metconazole)、邁克尼 (myclobutanil)、巴克素 (paclobutrazole)、平克座 (penconazole)、普克利 (propiconazole)、丙硫菌唑 (prothioconazole)、矽氟唑 (simeconazole)、得克利 (tebuconazole)、四克利 (tetraconazole)、三泰芬 (triadimefon)、三泰隆 (triadimenol)、滅菌唑 (triticonazole)、烯效唑 (uniconazole) ;

咪唑類：依滅列 (imazalil)、披扶座 (pefurazoate)、氟霜唑 (oxpoconazole)、撲克拉 (prochloraz)、賽福座 (triflumizole) ;

嘧啶類、吡啶類及六氫吡啶類：芬瑞莫(fenarimol)、尼瑞莫(nuarimol)、比芬諾(pyrifenox)、賽福寧(triforine)；

F.II-2) δ 14-還原酶抑制劑(胺類，例如嗎啉類、六氫吡啶類)

嗎啉類：十二嗎啉(aldimorph)、十二環嗎啉(dodemorph)、十二環嗎啉乙酸鹽、芬普福(fenpropimorph)、三得芬(tridemorph)；

六氫吡啶類：苯鏽定(fenpropidin)、粉病靈(piperalin)；

螺縮酮胺類：螺環菌胺(spiroxamine)；

F.II-3)3-酮基還原酶抑制劑：羥基苯胺類：環醯菌胺(fenhexamid)；

F.III)核酸合成抑制劑

F.III-1)RNA、DNA合成

苯基醯胺或醯基胺基酸殺真菌劑：本達樂(benalaxyl)、右本達樂(benalaxyl-M)、精苯霜靈(kiralaxyl)、滅達樂(metalaxyl)、右滅達樂(metalaxyl-M) (精甲霜靈(mefenoxam))、呋醯胺(ofurace)、毆殺斯(oxadixyl)；

異噁唑類及異噻唑啉酮類：殺紋寧(hymexazole)、辛噻酮(octhilinone)；

F.III-2)DNA拓撲異構酶抑制劑：歐索林酸(oxolinic acid)；

F.III-3)核苷酸代謝(例如腺苷脫胺酶)

羥基(2-胺基)-嘧啶類：布瑞莫(bupirimate)；

F.IV)細胞分裂及/或細胞骨架抑制劑

F.IV-1) 微管蛋白抑制劑：苯并咪唑類及硫芬酯 (thiophanate)：免賴得 (benomyl)、貝芬替 (carbendazim)、麥穗寧 (fuberidazole)、腐絕 (thiabendazole)、甲基多保淨 (thiophanate-methyl)；

三唑并嘧啶類：5-氯-7 (4-甲基六氫吡啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)-[1,2,4]三唑并[1,5 a]嘧啶

F.IV-2) 其他細胞分裂抑制劑

苯并醯胺及苯基乙醯胺：乙徽威 (diethofencarb)、噻唑菌胺 (ethaboxam)、賓克隆 (pencycuron)、氟比來 (fluopicolide)、座賽胺 (zoxamide)；

F.IV-3) 肌動蛋白抑制劑：二苯甲酮類：滅芬農 (metrafenone)；

F.V) 胺基酸及蛋白質合成抑制劑

F.V-1) 甲硫胺酸合成抑制劑 (苯胺基-嘧啶類)

苯胺基-嘧啶類：賽普洛 (cyprodinil)、滅派林 (mepanipyrim)、氯啶 (nitrapyrin)、派美尼 (pyrimethanil)；

F.V-2) 蛋白質合成抑制劑 (苯胺基-嘧啶類)

抗生素類：保米黴素 (blasticidin-S)、嘉賜黴素 (kasugamycin)、嘉賜黴素水合鹽酸鹽、米多黴素 (mildiomycin)、鏈黴素 (streptomycin)、土黴素 (oxytetracyclin)、保粒黴素 (polyoxine)、維利黴素 (validamycin A)；

F.VI) 信號轉導抑制劑

F.VI-1) MAP / 組胺酸激酶抑制劑 (例如苯胺基-嘧啶類)

二甲醯亞胺類：唑呋草 (fluoroimid)、依普同 (iprodione)、撲滅寧 (procymidone)、免克寧 (vinclozolin)；

苯基吡咯類：種子敷料各 (fenpiclonil)、護汰寧 (fludioxonil)；

F.VI-2)G蛋白質抑制劑：喹啉類：快諾芬 (quinoxifen)；

F.VII)脂質及膜合成抑制劑

F.VII-1)磷脂生物合成抑制劑

有機磷化合物：護粒松 (edifenphos)、丙基喜樂松 (iprobenfos)、白粉松 (pyrazophos)；

二硫戊環類：亞賜圃 (isoprothiolane)；

F.VII-2)脂質過氧化作用

芳族烴類：大克爛 (dicloran)、五氯硝基苯 (quintozene)、四氯硝基苯 (tecnazene)、脫克松 (tolclofomethyl)、聯苯、二氯甲氧苯 (chloroneb)、依得利 (etridiazole)；

F.VII-3)羧酸醯胺 (CAA殺真菌劑)

肉桂醯胺或扁桃醯胺：達滅芬 (dimethomorph)、氟嗎啉 (flumorph)、曼普胺 (mandipropamid)、吡嗎啉 (pyrimorph)；

鱗胺醯胺胺基甲酸酯類：苯噻菌胺 (benthiavalicarb)、丙森鋅 (iprovalicarb)、吡菌苯威 (pyribencarb)、霜黴滅 (valifenalate)及N-(1-(1-(4-氟基-苯基)乙烷磺醯基)-丁-2-基)胺基甲酸-(4-氟苯基)酯；

F.VII-4)影響細胞膜滲透性及脂肪酸之化合物

胺基甲酸酯類：霜黴威 (propamocarb)、普拔克

(propamocarb-hydrochlorid)

F.VIII)多位點作用抑制劑

F.VIII-1)無機活性物質：波爾多液(Bordeaux mixture)、乙酸銅、氫氧化銅、氧氯化銅、鹼式硫酸銅、硫黃；

F.VIII-2)硫代及二硫代胺基甲酸酯類：富爾邦(ferbam)、鋅錳乃浦(mancozeb)、錳乃浦(maneb)、美坦(metam)、滅速克(methasulphocarb)、免得爛(metiram)、甲基鋅乃浦(propineb)、得恩地(thiram)、鋅乃浦(zineb)、益穗(ziram)；

F.VIII-3)有機氯化化合物(例如鄰苯二甲醯亞胺類、磺醯胺類、氯腈類)：

敵菌靈(anilazine)、四氯異苯腈(chlorothalonil)、四氯丹(captafol)、克菌丹(captan)、福爾培(folpet)、益發靈(dichlofluanid)、二氯芬、氟硫滅(flusulfamide)、六氯苯(hexachlorobenzene)、五氯酚(pentachlorophenole)及其鹽、熱必斯(phthalide)、甲基益發靈(tolylfluanid)、N-(4-氯-2-硝基-苯基)-N-乙基-4-甲基-苯磺醯胺；

F.VIII-4)胍類：胍、多寧(dodine)、多寧游離鹼、雙胍辛(guazatine)、雙胍辛胺乙酸鹽(guazatine-acetate)、克熱淨(iminoctadine)、克熱淨乙酸鹽、克熱淨-叁(烷基苯磺酸鹽)；

F.VIII-5)蔥醯類：腈硫醯(dithianon)；

F.IX)細胞壁合成抑制劑

F.IX-1)葡聚糖合成抑制劑：維利黴素(validamycin)、保

粒黴素B；

F.IX-2)黑色素合成抑制劑：百快隆(pyroquilon)、三賽唑(tricyclazole)、加普胺(carpropamide)、雙環維特(dicyclomet)、芬諾尼(fenoxanil)；

F.X)植物防禦誘導劑

F.X-1)水楊酸路徑：阿拉酸式苯-S-甲基(acibenzolar-S-methyl)；

F.X-2)其他：撲殺熱(probenazole)、亞汰尼(isotianil)、噻鹽菌胺(tiadinil)、調環酸鈣(prohexadione-calcium)；

磷酸鹽：三乙磷酸(fosetyl)、福賽得(fosetyl-aluminum)、亞磷酸及其鹽；

F.XI)未知作用模式：

布羅波爾(bronopol)、螞離丹(chinomethionat)、賽芬胺(cyflufenamid)、克絕(cymoxanil)、邁隆(dazomet)、咪菌威(debacarb)、達滅淨(diclomezine)、燕麥枯(difenzoquat)、燕麥枯甲基硫酸鹽、二苯胺、氟聯苯菌(flumetover)、氟硫滅(flusulfamide)、氟噻菌淨(flutianil)、滅速克(methasulfocarb)、快得寧(oxin-copper)、丙氧喹啉(proquinazid)、異丁乙氧喹啉(tebufloquin)、克枯爛(tecloftalam)、咪唑嗪(triazoxide)、2-丁氧基-6-碘-3-丙基吡啶-4-酮、N-(環丙基甲氧基亞胺基-(6-二氟-甲氧基-2,3-二氟-苯基)-甲基)-2-苯基乙醯胺、N'-(4-(4-氯-3-三氟甲基-苯氧基)-2,5-二甲基-苯基)-N-乙基-N甲基甲脒、N' (4-(4-氯-3-三氟甲基-苯氧基)-2,5-二甲

基-苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、N'-(2-甲基-5-三氟甲基-4-(3-三甲基矽烷基-丙氧基)-苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、N'-(5-二氟甲基-2-甲基-4-(3-三甲基矽烷基-丙氧基)-苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、2-{1-[2-(5-甲基-3-三氟甲基-吡啶-1-基)-乙醯基]-六氫吡啶-4-基}-噻唑-4-甲酸甲基-(1,2,3,4-四氫-萘-1-基)-醯胺、2-{1-[2-(5-甲基-3-三氟甲基-吡啶-1-基)-乙醯基]-六氫吡啶-4-基}-噻唑-4-甲酸甲基-(R)-1,2,3,4-四氫-萘-1-基-醯胺、甲氧基-乙酸6-第三丁基-8-氟-2,3-二甲基-喹啉-4-基酯及N-甲基-2-{1-[(5-甲基-3-三氟甲基-1H-吡啶-1-基)-乙醯基]-六氫吡啶-4-基}-N-[(1R)-1,2,3,4-四氫萘-1-基]-4-噻唑甲醯胺、3-[5-(4-氯-苯基)-2,3-二甲基-異噁唑啉-3基]-吡啶、吡啶并異噁唑、5-胺基-2-異丙基-3-側氧基-4-鄰-甲苯基-2,3-二氫-吡啶-1甲硫羧酸S-烯丙基酯、N-(6-甲氧基-吡啶-3-基)環丙烷甲醯胺、5-氯-1-(4,6-二甲氧基-嘧啶-2-基)-2-甲基-1H-苯并咪唑、2-(4-氯-苯基)-N-[4-(3,4-二甲氧基-苯基)-異噁唑-5-基]-2-丙-2-炔基氧基-乙醯胺；

F.XI)生長調節劑：

離層酸(abscisic acid)、呋喃丹(amidochlor)、嘧啶醇(ancymidol)、6-苄基胺基嘌呤、芸苔素內酯(brassinolide)、比達寧(butralin)、克美素(chlormequat, chlormequat chloride)、氯化膽鹼、環丙酸醯胺(cyclanilide)、丁醯肼(daminozide)、調呋酸(dikegulac)、穫萎得(dimethipin)、2,6-二甲基吡啶、益收生長素

(ethephon)、氟節胺(flumetralin)、呋嘧醇(flurprimidol)、
 噻草酸(fluthiacet)、福芬素(forchlorfenuron)、赤黴酸、依
 納素(inabenfide)、吲哚-3-乙酸、馬來醯肼、氟草磺
 (mefluidide)、壯棉素(mepiquat) (壯棉素鹽酸鹽(mepiquat
 chloride))、萘乙酸、N 6 苄基腺嘌呤、巴克素
 (paclobutrazol)、調環酸(prohexadione) (調環酸鈣)、茉莉
 酸丙酯(prohydrojasmon)、噻苯隆(thidiazuron)、抑芽唑
 (triapenthenol)、脫葉磷(tributyl phosphorotrithioate)、
 2,3,5三碘苯甲酸、抗倒酯(trinexapac-ethyl)及烯效唑；

F.XII)生物控制劑

抗真菌生物控制劑：NRRL編號為B-21661之芽孢桿菌
 (*Bacillus subtilis*)菌株(例如購自AgraQuest公司，USA之
 RHAPSODY®、SERENADE® MAX及SERENADE® ASO)、
 NRRL編號為B-30087之短小芽孢桿菌(*Bacillus pumilus*)菌
 株(例如購自AgraQuest公司，USA之SONATA®及
 BALLAD® Plus)、奧德曼細基格孢(*Ulocladium
 oudemansii*) (例如購自BotriZen有限公司，New Zealand之
 產品BOTRY-ZEN)、甲殼素(例如購自BotriZen有限公司，
 New Zealand之ARMOUR-ZEN)。

可藉由業內已知之任一施加方法使無脊椎害蟲(亦稱作
 「動物害蟲」，即昆蟲、蜘蛛及線蟲)、植物、生長或可生
 長植物之土壤或水與本發明化合物或包含其之組合物接
 觸。因此，「接觸」包括直接接觸(將化合物/組合物直接施
 加至無脊椎害蟲或植物上-通常施加至植物之葉片、莖或

根)及間接接觸(將化合物/組合物施加至無脊椎害蟲或植物所在地)二者。

本發明化合物或包含其之殺蟲組合物可用於藉由使植物/作物與殺蟲有效量之本發明化合物接觸來保護生長中之植物及作物免受動物害蟲(尤其昆蟲、蠕蟲或蜘蛛)侵襲或侵擾。術語「作物」係指生長中之作物及已收穫之作物二者。

本發明化合物及包含其之組合物對於控制各種栽培植物上之大量昆蟲尤其重要，該等栽培植物例如，穀類、根塊作物、油料作物、蔬菜、香料、觀賞植物之種子，例如下述植物之種子：硬粒小麥及其他小麥、大麥、燕麥、黑麥、玉米(飼料玉米及甜玉米/甜玉米及飼料玉米)、大豆、油料作物、十字花科植物、棉花、向日葵、香蕉、水稻、油菜、球莖甘藍(turnip rape)、甜菜、飼料甜菜、茄子、馬鈴薯、草、草坪、草皮、牧草、番茄、韭菜、南瓜/西葫蘆、甘藍、捲心萵苣、胡椒、黃瓜、甜瓜、芸苔屬物種、甜瓜、豆類、豌豆、大蒜、洋蔥、胡蘿蔔、諸如馬鈴薯等塊莖植物、甘蔗、煙草、葡萄、牽牛花、老鸛草/天竺葵、三色堇及鳳仙花屬。

本發明化合物係以原狀態或以組合物形式藉由用殺昆蟲有效量之活性化合物處理昆蟲或擬針對昆蟲攻擊保護之植物、植物繁殖材料(例如種子)、土壤、表面、材料或生長地來使用。可在植物、植物繁殖材料(例如種子)、土壤、表面、材料或生長地被昆蟲感染之前或之後實施施加。

此外，可藉由使殺蟲有效量之本發明化合物與目標害蟲、其食物供應、棲息地、繁殖地或其所在地接觸來控制無脊椎害蟲。因此，可在所在地、生長中之作物或已收穫作物被害蟲感染之前或之後實施施加。

亦可預防性地將本發明化合物施加至預期害蟲會出現之位置。

本發明化合物亦可用於保護生長中之植物免受害蟲侵襲或侵擾，其係藉由使該植物與殺蟲有效量之本發明化合物接觸來實施。因此，「接觸」包括直接接觸(將化合物/組合物直接施加至害蟲及/或植物上-通常施加至植物葉片、莖或根)及間接接觸(將化合物/組合物施加至害蟲及/或植物所在地)。

「所在地」意指生長或可生長害蟲或寄生蟲之棲息地、繁殖地、植物、種子、土壤、區域、材料或環境。

一般而言，「殺寄生蟲有效量」意指對目標有機體之生長達成可觀測效果所需活性成份之量，該等效果包括壞死、死亡、延遲、預防效果及去除、消滅目標有機體、或以其他方式降低目標有機體之出現率及活性。對於本發明中所用各種化合物/組合物而言，殺蟲有效量可變。組合物之殺蟲有效量亦可根據主要條件(例如所期望殺蟲效果及持續時間、天氣、目標物種、所在地、施加模式及諸如此類)而改變。

在土壤處理或施加至害蟲聚居地或巢穴之情形下，活性成份之量介於 $0.0001 \text{ g}/100 \text{ m}^2$ 至 $500 \text{ g}/100 \text{ m}^2$ 、較佳地

0.001 g/100 m²至20 g/100 m²之間。

在保護材料時，常用施加速率為(例如) 0.01 g至1000 g 活性化合物/m²處理材料，期望值為0.1 g至50 g/m²。

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

對於處理作物植物之用途，本發明活性成份之施加比率可介於0.1 g至4000 g/公頃之間、較佳介於25 g至600 g/公頃之間、更佳在50 g至500 g/公頃之間。

本發明化合物可經由接觸(經由土壤、玻璃、牆壁、蚊帳、地毯、植物部分或動物部分)及攝食(誘餌或植物部分)來生效。

亦可對非作物昆蟲害蟲(例如螞蟥、白蟻、黃蜂、蠅、蚊子、蟋蟀或蟑螂)施加本發明化合物。對該等非作物害蟲使用時，本發明化合物較佳以誘餌組合物使用。

誘餌可為液體、固體或半固體製劑(例如凝膠)。固體誘餌可形成適於各種應用之不同形狀與形式，例如顆粒、塊、棒、盤。可將液體誘餌填充至各種裝置中以確保正確施加，例如開口容器、噴霧裝置、液滴源或蒸發源。凝膠可基於水性或油性基質並可根據黏稠度、保濕性或老化特性之具體需要來調配。

組合物中所用誘餌係具有充分吸引力來引誘諸如螞蟥、白蟻、黃蜂、蠅、蚊子、蟋蟀等或蟑螂等昆蟲食用其之產物。可藉助攝食刺激劑或性費洛蒙(sex pheromone)來操縱

吸引力。食物刺激劑係非排他地選自(例如)動物及/或植物蛋白(肉粉、魚粉或血粉、昆蟲部分、蛋黃)、動物及/或植物源脂肪及油、或單糖、寡糖或有機多糖，尤其蔗糖、乳糖、果糖、右旋糖、葡萄糖、澱粉、果膠或甚至糖蜜或蜂蜜。水果、作物、植物、動物、昆蟲之新鮮或腐爛部分或其特定部分亦可用作攝食刺激劑。已知性費洛蒙具有更強昆蟲特異性。具體費洛蒙闡述於文獻中並已為熟習此項技術者所知。

為用於誘餌組合物中，活性成份之典型含量為0.001重量%至15重量%、合意地0.001重量%至5%重量%之活性成份。

呈氣溶膠(例如存於噴霧罐中)、油噴霧或幫浦噴霧形式之本發明化合物之調配物非常適於供非專業使用者來控制諸如蠅、蚤、蟬、蚊子或蟑螂等害蟲。氣溶膠配方較佳由下列組成：活性化合物；溶劑，例如低碳醇(例如甲醇、乙醇、丙醇、丁醇)、酮(例如丙酮、甲基乙基酮)、沸點介於約50℃至250℃之間之石蠟烴(例如煤油)、二甲基甲醯胺、N-甲基吡咯啉酮、二甲基亞砷、芳族烴(例如甲苯、二甲苯)、水；及輔助劑，例如乳化劑(例如山梨糖醇單油酸酯、具有3至7莫耳環氧乙烷之油基乙氧化物、脂肪醇乙氧化物；芳香油(例如香精油)、中碳脂肪酸與低碳醇之酯、芳族羰基化合物、(若適宜)穩定劑(例如苯甲酸鈉)、兩性表面活性劑、低碳環氧化物、原甲酸三乙酯及(若需要)推進劑(例如丙烷、丁烷、氮氣、壓縮空氣、二甲醚、

二氧化碳、氧化亞氮或此等氣體之混合物)。

由於不使用推進劑，油性噴霧調配物與氣溶膠配方不同。

為用於噴霧組合物中，活性成份之含量為0.001重量%至80重量%、較佳0.01重量%至50重量%且最佳0.01重量%至15重量%。

本發明化合物及其各別組合物亦可用於蚊香及薰蒸香、熏煙匣、蒸發板或長效蒸發器中，且亦可用於防蛀紙、防蛀墊或其他不需加熱之蒸發器系統中。

用本發明化合物及其各別組合物來控制由昆蟲傳播之傳染性疾病(例如瘧疾、登革熱及黃熱病、淋巴性絲蟲病及利什曼病(leishmaniasis))之方法亦包含處理棚屋與房屋表面、空氣噴霧及浸漬窗簾、帳篷、衣物、蚊帳、采采蠅捕集器或諸如此類。施加至纖維製品、織物、針織品、非織物、網狀材料或箔及防水布之殺昆蟲組合物較佳包含包括殺昆蟲劑、(視需要)驅避劑及至少一種黏合劑之混合物。適宜驅避劑係(例如) N,N-二乙基-間-甲苯甲醯胺(DEET)、N,N-二乙基苯基乙醯胺(DEPA)、1-(3-環己-1-基-羰基)-2-甲基六氫吡啶、(2-羥甲基環己基)乙酸內酯、2-乙基-1,3-己二醇、避蚊酮(indalone)、甲基新癸醯胺(MNDA)、不用於昆蟲控制之擬除蟲菊酯(例如 {(+/-)-3-烯丙基-2-甲基-4-氧代環戊-2-(+)-烯基-(+)-反-菊酸酯(賜百寧(Esbiothrin)))、得自植物提取物或與植物提取物相同之驅避劑(如檸檬油精、丁香酚、(+)-尤卡醇(Eucamalol) (1)、

(-)-1-表-尤卡醇)、或得自以下植物之粗製植物提取物：如斑皮桉 (*Eucalyptus maculata*)、白背蔓荊 (*Vitex rotundifolia*)、馬丁香 (*Cymbopogon martinii*)、檸檬香茅 (*Cymbopogon citratus*) (檸檬草)、香茅 (*Cymbopogon nartdus, cittonella*)。舉例而言，適宜黏合劑選自下列之聚合物及共聚物：脂肪族酸之乙烯基酯(例如乙酸乙烯酯及柯赫酸乙烯酯(vinyl versatate))、醇之丙烯酸酯及甲基丙烯酸酯(例如丙烯酸丁酯、丙烯酸2-乙基己基酯及丙烯酸甲酯)、單-及二烯系不飽和烴(例如苯乙烯)及脂肪族二烯(例如丁二烯)。

窗簾及蚊帳之浸漬一般藉由將織物材料浸入殺昆蟲劑之乳液或分散液中或將其噴霧至網上來實施。

本發明化合物及其組合物可用於保護木製材料(例如樹、木柵欄、枕木等)及建築物(例如房屋、庫房、工廠)，以及建築材料、傢具、皮革、纖維、乙烯物品、電線及電纜等免受螞蟻及/或白蟻之侵害，且用於控制螞蟻及白蟻以使其不會對作物或人類造成傷害(例如，當害蟲入侵房屋及公共設施時)。本發明化合物不僅可施加至周圍土壤表面或地板下土壤中以保護木質材料，且亦可將其施加至塊狀物品(例如地板下混凝土、壁櫥柱、樑、膠合板、傢具等之表面)、木質物品(例如刨花板、半板等)及乙烯製品(例如經塗覆電線、乙烯板、隔熱材料(例如苯乙烯發泡體)等)。在防禦螞蟻危害作物或人類之應用情況下，可將本發明之螞蟻控制劑施加至作物上或周圍土壤中，或直接施

加至螞蟻巢穴中或諸如此類。

因此本發明化合物適用於處理植物繁殖材料(尤其種子)以保護其免受昆蟲害蟲(尤其土壤中生存之昆蟲害蟲)之侵害，及保護所得植物之根及芽抵抗土壤害蟲及葉片害蟲。

本發明化合物尤其可用於保護種子免受土壤害蟲之侵害及所得植物之根及芽抵抗土壤害蟲及葉片昆蟲。較佳保護所得植物之根及芽。更佳保護所得植物之芽免受刺穿及吮吸昆蟲侵害，其中最佳保護免受蚜蟲侵害。

因此，本發明包含保護種子免受昆蟲(尤其土壤昆蟲)侵害並保護幼苗之根及芽免受昆蟲(尤其土壤及葉片昆蟲)侵害之方法，該方法包含在播種前及/或在催芽後使種子與本發明化合物(包括其鹽)接觸。尤佳者係保護植物之根及芽之方法，更佳者係保護植物之芽免受刺穿及吮吸昆蟲侵害之方法，最佳者係保護植物之芽免受蚜蟲侵害之方法。

術語種子涵蓋種子及所有種類的植物繁殖體，包括但不限於真種子、插條、吸根、球根、球莖、果實、塊莖、穀粒、切塊、切枝及諸如此類，且在較佳實施例中意指真種子。

術語種子處理包含業內已知的所有適當種子處理技術，例如種子敷料、種子包衣、種子撒粉、浸種及種子丸粒化。

本發明亦包含塗覆有或含有活性化合物之種子。

術語「塗覆有及/或含有」一般表示在施加時活性成份大部分存於繁殖產品表面上，但該成份或多或少可滲入繁

殖產品中，此視施加方法而定。當(重新)種植該繁殖產品時，其可吸收活性成份。

適宜種子係穀類、根塊作物、油料作物、蔬菜、香料、觀賞植物之種子，例如下列之種子：硬粒小麥及其他小麥、大麥、燕麥、黑麥、玉米(飼料玉米及甜玉米/甜玉米及飼料玉米)、大豆、油料作物、十字花科植物、棉花、向日葵、香蕉、水稻、油菜、球莖甘藍、甜菜、飼料甜菜、茄子、馬鈴薯、草、草坪、草皮、牧草、番茄、韭菜、南瓜/西葫蘆、甘藍、捲心莖、胡椒、黃瓜、甜瓜、芸苔屬物種、甜瓜、豆類、豌豆、大蒜、洋蔥、胡蘿蔔、諸如馬鈴薯等塊莖植物、甘蔗、煙草、葡萄、牽牛花、老鸛草/天竺葵、三色堇及鳳仙花屬。

此外，該活性化合物亦可用於處理因育種(包括遺傳工程方法)而可耐受除草劑或殺真菌劑或殺昆蟲劑作用之植物的種子。

舉例而言，可使用該活性化合物處理對由磺胺脲、咪唑啉酮、固殺草(glufosinate-ammonium)或草甘膦-異丙銨及類似活性物質組成之群之除草劑具有抗性之植物的種子(例如，參見 EP-A 242 236、EP-A 242 246、WO 92/00377、EP-A 257 993、US 5,013,659)，或將其用於能產生可使植物對某些害蟲具有抗性之蘇雲金芽孢桿菌毒素(Bt毒素)之轉基因作物(例如棉花)中(EP-A 142 924、EP-A 193 259)。

此外，該活性化合物亦可用於處理與可藉由(例如)傳統

育種方法及/或突變體產生、或藉由重組程序產生之現存植物相比具有經改變特性之植物的種子。舉例而言，人們已闡述多個為改變植物中所合成澱粉之目的而對作物植物實施重組改變之事例(例如 WO 92/11376、WO 92/14827、WO 91/19806)或對具有經改變脂肪酸構成之轉基因作物植物所述重組改變之事例(WO 91/13972)。

該活性化合物之種子處理應用係藉由在植物播種前及在植物出芽前對種子進行噴霧或撒施來實施。

尤其可用於種子處理之組合物為(例如)：

- A 可溶性濃縮物(SL、LS)
- D 乳液(EW、EO、ES)
- E 懸浮液(SC、OD、FS)
- F 水可分散性顆粒及水溶性顆粒(WG、SG)
- G 水可分散性粉末及水溶性粉末(WP、SP、WS)
- H 凝膠調配物(GF)
- I 可撒施粉末(DP、DS)

習用種子處理調配物包括(例如)可流動濃縮物FS、溶液LS、乾燥處理用粉劑DS、漿液處理用水可分散性粉劑WS、水溶性粉劑SS及乳液ES與EC及凝膠調配物GF。此等調配物可在稀釋後或不經稀釋即施加至種子。可在播種前實施向種子之施加，直接施加至種子上，或在已對種子實施催芽後施加。

在較佳實施例中，用FS調配物進行種子處理。通常FS調配物可包含1 g/l至800 g/l活性成份、1 g/l至200 g/l表面活

性劑、0 g/l至200 g/l防凍劑、0 g/l至400 g/l黏合劑、0 g/l至200 g/l顏料及至多1升溶劑(較佳為水)。

用於種子處理之本發明化合物之尤佳FS調配物通常包含0.1重量%至80重量%(1 g/l至800 g/l)活性份、0.1重量%至20重量%(1 g/l至200 g/l)之至少一種表面活性劑(例如0.05%至5%之潤濕劑及0.5重量%至15重量%之分散劑)、至多20重量%(例如5%至20%)之防凍劑、0重量%至15重量%(例如1重量%至15重量%)之顏料及/或染料, 0重量%至40重量%(例如1重量%至40重量%)之黏合劑(膠黏劑/黏著劑), 視情況至多5重量%(例如0.1重量%至5重量%)之增稠劑, 視情況0.1%至2%之消泡劑, 及視情況(例如) 0.01重量%至1重量%之量的防腐劑(例如殺蟲劑、抗氧化劑或諸如此類)及補足至100重量%之填充劑/媒劑。

種子處理調配物亦可另外包含黏合劑及(視情況)著色劑。

可在處理後添加黏合劑以改良活性材料在種子上之黏著。適宜黏合劑係伸烷基氧化物(環氧乙烷或環氧丙烷)之均聚物及共聚物、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇、聚乙烯基吡咯啉酮及其共聚物、乙烯-乙酸乙烯酯共聚物、丙烯酸系均聚物及共聚物、聚乙烯胺、聚乙烯醯胺及聚乙烯亞胺、聚糖(纖維素、甲基纖維素及澱粉)、聚烯烴均聚物及共聚物(如烯烴/馬來酸酐共聚物)、聚胺基甲酸酯、聚酯、聚苯乙烯均聚物及共聚物。

視情況, 調配物中亦可包括著色劑。適用於種子處理調

配物之著色劑或染料係羅丹明B (Rhodamin B)、C.I.顏料紅112、C.I.溶劑紅1、顏料藍15:4、顏料藍15:3、顏料藍15:2、顏料藍15:1、顏料藍80、顏料黃1、顏料黃13、顏料紅112、顏料紅48:2、顏料紅48:1、顏料紅57:1、顏料紅53:1、顏料橙43、顏料橙34、顏料橙5、顏料綠36、顏料綠7、顏料白6、顏料棕25、鹼性紫10、鹼性紫49、酸性紅51、酸性紅52、酸性紅14、酸性藍9、酸性黃23、鹼性紅10、鹼性紅108。

膠凝劑之實例為角叉菜(Satiagel®)。

在種子處理中，本發明化合物之施加速率通常係0.1 g至10 kg/100 kg種子，較佳係1 g至5 kg/100 kg種子，更佳係1 g至1000 g/100 kg種子且尤其1 g至200 g/100 kg種子。

因此，本發明亦係關於如本文所定義之包含本發明化合物(包括其農業上可用鹽)之種子。本發明化合物(包括其農業上可用之鹽)之量一般係將在0.1 g至10 kg/100 kg種子之間變化，較佳係1 g至5 kg/100 kg種子，尤其1 g至1000 g/100 kg種子。對於特定作物(例如萵苣)而言，施加率可更高。

原則上，可用於處理種子之方法係業內已知之所有適宜種子處理技術，且尤其種子敷料技術，例如種子包衣(例如種子丸粒化)、種子撒粉及種子吸脹(例如浸種)。在本文中，「種子處理」係指使種子與本發明化合物彼此接觸之所有方法，且「種子敷料」係指向種子提供一定量之本發明化合物之種子處理方法，即其產生包含本發明化合物之

種子。在原則上，可在種子收穫後至播種種子期間任何時間對種子實施處理。可在即將種植種子之前或在種植種子期間使用(例如)「播種箱」方法來處理種子。然而，亦可在種植種子之前若干周或若干個月(例如至多12個月)(例如)以種子敷料處理形式實施處理，其中未觀察到效能大幅度降低。

可方便地對未播種種子實施處理。本文所用術語「未播種種子」意指包括自種子收穫至出於植物萌芽及生長目的而將種子播種於土地中期間任一階段之種子。

具體而言，在處理中遵循一定程序，其中在適宜裝置(例如用於混合固體或固/液配合物之混合裝置)中將種子與期望量之未經處理或預先用水稀釋之種子處理調配物混合直至該組合物在種子上均勻分佈。若適宜，在此之後實施乾燥步驟。

實例

A. 製備實例

適當改變起始材料，使用下文合成實例中所給出之程序來獲得其他化合物I。以此方式獲得之化合物連同物理數據列示於下表中。

下文所示產物由下列來表徵：熔點測定、NMR譜或藉由HPLC-MS或HPLC光譜測定之質量([m/z])或滯留時間(RT；[min.])。

HPLC-MS=高效液相層析耦合質譜；HPLC法：

方法1：RP-18管柱(來自Merck KGaA, Germany之

Chromolith® Speed ROD), 50*4.6 mm; 流動相: 乙腈+0.1%三氟乙酸(TFA)/水+0.1% TFA, 使用在40°C下經5分鐘5:95至100:0之梯度。流速1.8 ml/min。

方法2: Phenomenex Kinetex 1.7 μ m XB-C18 100A; 50 $\times$ 2.1 mm; 流動相: A: 水+0.1%三氟乙酸(TFA); B: 乙腈+0.1% TFA; 梯度: 在1.50分鐘內5%至100% B; 100% B 0.20 min; 流速: 在1.50分鐘內0.8 ml/min至1.0 ml/min, 在60°C下。MS: 四極電噴霧電離, 80 V (正離子模式)。

方法3: 管柱: CHIRALPAK® IA 5 μ m-250 $\times$ 4.6 mm; 流動相: 庚烷/二氯甲烷/乙醇/二乙胺 50/50/1/0.1; 流速: 1 ml/min; 檢測: UV 280 nm; 25°C。

方法4: 管柱: CHIRALPAK® IC 5 μ m-250 $\times$ 4.6 mm; 流動相: 乙醇/甲醇 50/50; 流速: 0.7 ml/min; 檢測: UV 280 nm; 25°C。

實例1: 5-甲基-1-(2,2,2-三氟-1-三氟甲基-乙基)-1H-吡唑-4-甲酸嗒吡-4-基醯胺[I-34]之製備

在0°C下向398 mg 5-甲基-1-[2,2,2-三氟-1-(三氟甲基)乙基]吡唑-4-羧基氯於10 ml CH₂Cl₂中之溶液中逐滴添加185 mg嗒吡-4-胺及750 mg三乙胺於30 ml CH₂Cl₂中之溶液。在20°C至25°C下將混合物攪拌約68 h, 用25 ml乙酸乙酯稀釋, 用3 $\times$ 15 ml飽和NH₄Cl水溶液洗滌, 經MgSO₄乾燥並蒸發。藉由急驟層析(CH₂Cl₂/MeOH)來實施純化, 得到160 mg標題化合物(純度為90%)。HPLC-MS (方法1): RT 2.278 min, m/z [MH]⁺ 354.1。

實例 2：N,5-二甲基-N-嗒吡-4-基-1-[2,2,2-三氟-1-(三氟甲基)乙基]吡啶-4-甲醯胺[I-38]之製備

在 20°C 至 25°C 下將 300 mg 5-甲基-1-[2,2,2-三氟-1-(三氟甲基)乙基]吡啶-4-甲酸、127 mg N-甲基嗒吡-4-胺、710 mg O-(7-氮雜苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲鎗六氟磷酸鹽[HATU]及 220 mg 三乙胺於 30 ml THF 中之混合物攪拌約 24 h，然後蒸發。將殘餘物吸收於 21 ml CH₂Cl₂中，用 3×14 ml 水洗滌，經 Na₂SO₄乾燥，然後蒸發。藉由急驟層析(CH₂Cl₂/MeOH)來實施純化，得到 130 mg 標題化合物(純度為 90%)。

HPLC-MS (方法 1)：RT 2.271 min，m/z [MH]⁺ 368.1。

實例 3：在以下條件下藉由製備型層析來實施對映異構體 I-381 與 I-382 之分離：管柱：CHIRALPAK® AD-H 5 μm-250×30 mm；流動相：二氧化碳/乙醇 90/10；流速：120 ml/min；檢測：UV 280 nm；背壓：150 巴；溫度：25°C。

2 g 粗製材料 I-377 得到 978 mg (+)-對映異構體 I-381 及 972 mg (-)-對映異構體 I-382，每一者 >99% ee。

實例 4：在以下條件下藉由製備型層析來實施對映異構體 I-383 及 I-384 之分離：CHIRALPAK® IC 5 μm-250×30 mm；流動相：二氧化碳/乙醇 70/30；流速：120 ml/min；檢測：UV 280 nm；背壓：150 巴；溫度：25°C。

2 g 粗製材料 I-373 得到 864 mg (+)-對映異構體 I-383 (98.4% ee) 及 898 mg (-)-對映異構體 I-384 (98.0% ee)。

表 I - 式 I 化合物 (異構體 T-A)

編號	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理數據 (HPLC / MS)		
								RT [min]	方法	m/z [MH] ⁺
I-1	O	N	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ -		H	1.599	1	244.1
I-2	O	N	H	CH ₃	CH ₂ S(O) ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1.553	1	338.1
I-3	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ S(O) ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1.520	1	352.1
I-4	O	N	H	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	1.714	1	276.1
I-5	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	1.638	1	290.2
I-6	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -		H	2.289	1	300.2
I-7	O	N	CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -		H	2.114	1	286.2
I-8	O	N	H	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -		H	2.169	1	272.1
I-9	O	N	H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	2.014	1	260.1
I-10	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	2.119	1	288.2
I-11	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	1.941	1	274.2
I-12	O	N	H	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		H	2.383	1	286.2
I-13	O	N	CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		H	2.306	1	300.2
I-14	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		H	2.459	1	314.2
I-15	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -		H	2.105	1	286.2
I-16	O	N	CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -		H	1.876	1	272.1
I-17	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃	CH ₃	H	2.098	1	332.2
I-18	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃	CH ₃	H	2.229	1	346.2
I-19	O	N	H	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -		H	1.984	1	258.1
I-20	O	N	H	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃	CH ₃	H	2.118	1	318.2
I-21	O	N	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		H	1.643	1	288.1
I-22	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		H	1.634	1	316.1

編號	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理數據 (HPLC / MS)	
								RT [min]	m/z [MH] ⁺
I-23	O	N	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		H	1.562	302.2
I-24	O	N	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	c-C ₃ H ₅	CH ₃	H	2.416	330.2
I-25	O	N	H	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	1.965	290.2
I-26	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	1.908	304.2
I-27	O	N	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	2.463	358.1
I-28	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₂ CHF _{CF₃}	CH ₃	H	2.562	396.1
I-29	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₂ CHF ₂	CH ₃	H	2.106	346.1
I-30	O	N	H	CH ₃	CF ₂ CHF _{CF₃}	CH ₃	H	2.552	382.1
I-31	O	N	H	CH ₃	CF ₂ CHF ₂	CH ₃	H	2.144	332.1
I-32	O	N	H	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₃	1.817	271.1
I-33	O	N	CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₃	1.762	285.0
I-34	O	N	H	CH ₃	CF ₃	CF ₃	H	2.278	354.1
I-35	O	N	H	CH ₃	CN	CH ₃	H	1.423	257.1
I-36	O	N	CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	H	1.401	271.1
I-37	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CF ₃	H	2.519	382.1
I-38	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CF ₃	H	2.271	368.1
I-39	O	N	H	CH ₃	1-F-c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	1.910	290.1
I-40	O	N	CH ₃	CH ₃	1-F-c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	1.838	304.1
I-41	O	N	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	2.436	288.2
I-42	O	N	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	2.398	302.2
I-43	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	2.509	332.2
I-44	O	C	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	2.282	287.2
I-45	O	C	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	2.139	301.2
I-46	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	2.532	316.2

編號	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理數據 (HPLC / MS)		
								RT [min]	方法	m/z [MH] ⁺
I-47	O	N	H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.129	1	274.2
I-48	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.071	1	288.2
I-49	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.231	1	318.2
I-50	O	C	H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.110	1	273.2
I-51	O	C	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	1.946	1	287.2
I-52	O	N	H	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.734	1	328.1
I-53	O	N	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.788	1	342.1
I-54	O	N	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.955	1	372.2
I-55	O	C	H	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.523	1	327.1
I-56	O	N	H	CF ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	2.936	1	342.1
I-57	O	N	CH ₃	CF ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	3.049	1	356.2
I-58	O	N	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	3.278	1	386.2
I-59	O	C	H	CF ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	2.781	1	341.2
I-60	O	C	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	o-C ₃ H ₅	CH ₃	H	2.134	1	329.1
I-61	S	C	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	2.351	1	329.0
I-62	S	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	o-C ₃ H ₅	CH ₃	H	2.569	1	315.2
I-63	S	C	H	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	2.246	1	315.1
I-64	S	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	2.524	1	343.0
I-65	O	N	H	CH ₃	-CCl ₂ CH ₂ -	-CCl ₂ CH ₂ -	H	2.143	1	312.0
I-66	O	N	CH ₃	CH ₃	-CCl ₂ CH ₂ -		H	2.073	1	326.0
I-67	O	C	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	0.868	2	357.2
I-68	O	N	H	CH ₃	CH=CH ₂	CH ₃	H	0.716	2	258.0
I-69	O	N	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	CH ₃	H	0.708	2	272.0
I-70	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	CH ₃	H	0.761	2	286.1

編號	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理數據 HPLC / MS		
								RT [min]	方法	m/z [MH] ⁺
I-71	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	CH ₃	H	0.776	2	302.1
I-72	O	C	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.597	1	341.1
I-73	O	N	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		H	0.727	2	315.1
I-74	O	N	H	CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H	1.525	1	271.1
I-75	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H	1.466	1	285.1
I-76	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H	1.647	1	299.2
I-77	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H	1.669	1	315.1
I-78	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H	0.613	2	298.2
I-79	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.866	2	342.2
I-80	O	N	H	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.797	2	314
I-81	O	C	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.767	2	327.2
I-82	O	N	H	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CN	0.831	2	311.1
I-83	O	C	H	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.783	2	313.2
I-84	O	C	CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CN	0.809	2	324.1
I-85	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.806	2	328.1
I-86	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.833	2	341.1
I-87	O	N	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.944	2	372.2
I-88	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.884	2	358.2
I-89	O	N	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		H	0.502	2	301.2
I-90	O	C	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		H	0.497	2	300.1
I-91	O	C	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.848	2	357.2
I-92	O	N	CH ₃	CH ₃	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	1.584	1	311.1
I-93	O	N	H	CH ₃	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	1.739	1	297.1
I-94	O	C	H	CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H	1.504	1	270.1

編號	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理數據 (HPLC / MS)		
								RT [min]	方法	m/z [MH] ⁺
I-95	O	N	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	2.108	1	274.1
I-96	O	N	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	2.063	1	288.1
I-97	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.946	2	318.1
I-98	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.838	2	302.4
I-99	O	C	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	2.030	1	273.1
I-100	O	C	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	1.859	1	287.1
I-101	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	2.000	1	301.1
I-102	O	N	H	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	0.795	2	314.2
I-103	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.011	1	328.1
I-104	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.172	1	342.1
I-105	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.210	1	358.1
I-106	O	C	H	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.128	1	313.1
I-107	O	C	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	1.956	1	327.1
I-108	O	C	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.146	1	357.0
I-109	O	C	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H	1.307	1	284.0
I-110	O	N	CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CF ₃	2.596	1	368.1
I-111	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CF ₃	2.719	1	382.1
I-112	O	N	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CF ₃	1.075	2	412.2
I-113	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CF ₃	2.775	1	398.1
I-114	O	N	H	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CF ₃	0.948	2	354.2
I-115	O	C	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.812	2	371.4
I-116	O	C	H	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.842	2	321.1
I-117	O	C	CH ₃	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.842	2	335.2
I-118	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.899	2	349.2

編號	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理數據	
								RT [min]	方法
I-119	O	N	H	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.866	2
I-120	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.874	2
I-121	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.923	2
I-122	O	C	H	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CF ₃	0.917	2
I-123	O	C	CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CF ₃	0.917	2
I-124	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CF ₃	0.975	2
I-125	O	N	H	CH ₃	3-<PY>	CH ₃	H	1.198	1
I-126	O	N	H	CH ₃	4-<PY>	CH ₃	H	1.217	1
I-127	O	N	CH ₃	CH ₃	4-<PY>	CH ₃	H	1.159	1
I-128	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CF ₃	0.841	2
I-129	O	N	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CF ₃	0.791	2
I-130	O	N	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CF ₃	0.778	2
I-131	O	C	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CF ₃	1.865	1
I-132	O	C	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CF ₃	0.761	2
I-133	O	N	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	1.717	1
I-134	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	1.667	1
I-135	O	C	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	0.666	2
I-136	O	C	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	1.538	1
I-137	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	0.717	2
I-138	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	0.747	2
I-139	O	N	CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CN	2.226	1
I-140	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CN	2.343	1
I-141	O	N	H	CH ₃	CH ₂ F	CH ₃	H	0.654	2
I-142	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ F	CH ₃	H	0.645	2

編號	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理數據 (HPLC / MS)		
								RT [min]	方法	m/z [MH] ⁺
I-143	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ F	CH ₃	H	0.719	2	292.3
I-144	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ F	CH ₃	H	0.684	2	291.2
I-145	O	C	H	CH ₃	CH ₂ F	CH ₃	H	1.443	1	263.1
I-146	O	C	CH ₃	CH ₃	CH ₂ F	CH ₃	H	1.008	1	277.1
I-147	O	N	CH ₃	CH ₃	3-<PY>	CH ₃	H	1.034	1	323.1
I-148	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-<PY>	CH ₃	H	1.300	1	337.1
I-149	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-<PY>	CH ₃	H	1.243	1	336.1
I-150	O	C	CH ₃	CH ₃	3-<PY>	CH ₃	H	1.056	1	322.1
I-151	O	C	H	CH ₃	3-<PY>	CH ₃	H	1.124	1	308.1
I-152	O	C	H	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CN	2.275	1	310.1
I-153	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CN	0.906	2	339.5
I-154	O	N	H	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.708 (A)	2	278.2
I-155	O	N	CH ₃	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.708 (A)	2	292.5
I-156	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.765 (A)	2	306.1
I-157	O	C	H	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.686 (A)	2	277.3
I-158	O	C	CH ₃	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.677 (A)	2	291.2
I-159	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.731 (A)	2	305.5
I-160	O	C	H	CH ₃	4-<PY>	CH ₃	H	0.504	2	308.1
I-161	O	N	H	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.698 (B)	2	278.1
I-162	O	N	CH ₃	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.692 (B)	2	292.3
I-163	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.743 (B)	2	306.1
I-164	O	C	H	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.675 (B)	2	277.1
I-165	O	C	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CF ₃	0.756 (S)	2	369.1
I-166	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CF ₃	2.010 (S)	1	383.1

編號	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理數據 (HPLC/MS)		
								RT [min]	方法	m/z [MH] ⁺
I-167	O	N	H	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.837	2	308.3
I-168	O	N	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.842	2	322.3
I-169	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.884	2	336.3
I-170	O	C	H	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.792	2	307.4
I-171	O	C	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.792	2	321.1
I-172	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.845	2	335.5
I-173	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₃	0.747	2	299.3
I-174	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	0.773	2	332.3
I-175	O	N	H	CH ₃	<TP>4	CH ₃	H	0.695	2	316.4
I-176	O	N	CH ₃	CH ₃	<TP>4	CH ₃	H	0.690	2	330.5
I-177	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	<TP>4	CH ₃	H	0.740	2	344.6
I-178	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	<TP>4	CH ₃	H	0.721	2	343.3
I-179	O	C	H	CH ₃	<TP>4	CH ₃	H	1.682	1	315.1
I-180	O	C	CH ₃	CH ₃	<TP>4	CH ₃	H	0.664	2	329.3
I-181	O	N	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ -		CN	0.625	2	283.0
I-182	O	N	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ -		CN	0.634	2	269.1
I-183	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ -		CN	0.679	2	297.0
I-184	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.656 (B)	2	305.4
I-185	O	C	CH ₃	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.656 (B)	2	291.3
I-186	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	4-<PY>	CH ₃	H	1.293	1	336.1
I-187	O	C	CH ₃	CH ₃	4-<PY>	CH ₃	H	1.088	1	322.1
I-188	O	N	H	CH ₃	2-<PY>	CH ₃	H	0.611	2	309.3
I-189	O	N	CH ₃	CH ₃	2-<PY>	CH ₃	H	0.601	2	323.3
I-190	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2-<PY>	CH ₃	H	0.653	2	337.3

編號	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理數據 (HPLC / MS)		
								RT [min]	方法	m/z [MH] ⁺
I-191	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2-<PY>	CH ₃	H	0.633	2	336.5
I-192	O	C	CH ₃	CH ₃	2-<PY>	CH ₃	H	0.581	2	322.3
I-193	O	C	H	CH ₃	2-<PY>	CH ₃	H	0.592	2	308.3
I-194	O	N	CH ₃	CH ₃	(6-Cl-3-<PY>)CH ₂	CH ₃	H	0.778	2	371.1
I-195	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	(6-Cl-3-<PY>)CH ₂	CH ₃	H	0.818	2	385.1
I-196	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₃	0.720	2	298.0
I-197	O	C	CH ₃	CH ₃	(6-Cl-3-<PY>)CH ₂	CH ₃	H	0.761	2	370.1
I-198	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-CN-C-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.717	2	325.1
I-199	O	N	H	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	H	0.687	2	282.2
I-200	O	N	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	H	0.680	2	296.3
I-201	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	H	0.737	2	310.4
I-202	O	C	H	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	H	0.666	2	281.3
I-203	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	H	0.706	2	309.3
I-204	O	C	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	H	0.639	2	295.3
I-205	O	N	H	CH ₃	-C ₆ H ₄ -2-OCH ₂ CH ₂ -		H	0.801	2	336.2
I-206	O	N	CH ₃	CH ₃	-C ₆ H ₄ -2-OCH ₂ CH ₂ -		H	0.800	2	350.2
I-207	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-C ₆ H ₄ -2-OCH ₂ CH ₂ -		H	0.845	2	364.4
I-208	O	C	H	CH ₃	-C ₆ H ₄ -2-OCH ₂ CH ₂ -		H	0.787	2	335.3
I-209	O	C	CH ₃	CH ₃	-C ₆ H ₄ -2-OCH ₂ CH ₂ -		H	0.782	2	349.3
I-210	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-C ₆ H ₄ -2-OCH ₂ CH ₂ -		H	0.838	2	363.3
I-211	O	C	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ -		H	0.488	2	321.2
I-212	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ -		H	0.545	2	335.2
I-213	O	N	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N[C(O)CH ₃]CH ₂ CH ₂ -		H	0.605	2	343.2
I-214	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ -		H	0.603	2	336.2

編號	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理數據 (HPLC / MS)		
								RT [min]	方法	m/z [MH] ⁺
I-215	O	C	H	CH ₃	-CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ -		H	0.511	2	307.2
I-216	O	N	H	CH ₃	-CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ -		H	0.523	2	308.2
I-217	O	N	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ -		H	0.511	2	322.2
I-218	O	N	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ SCH ₂ -		H	0.686	2	290.1
I-219	O	N	H	CH ₃	-CH ₂ SCH ₂ -		H	0.693	2	276.1
I-220	O	N	H	CH ₃	(6-Cl-3-<PY>)CH ₂	CH ₃	H	1.961	1	357.1
I-221	O	C	H	CH ₃	-CH ₂ SCH ₂ -		H	0.677	2	275.1
I-222	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	(6-Cl-3-<PY>)CH ₂	CH ₃	H	1.986 (S)	1	384.2
I-223	O	C	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ SCH ₂ -		H	0.666	2	289.1
I-224	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-CH ₂ SCH ₂ -		H	0.676	2	303.1
I-225	O	N	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	0.914	2	316.4
I-226	O	N	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	0.909	2	302.3
I-227	O	C	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	0.873	2	301.5
I-228	O	C	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	0.881	2	315.5
I-229	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	0.953	2	329.4
I-230	O	C	H	CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.716	2	317.2
I-231	O	N	H	CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.731	2	318.1
I-232	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.785	2	346.2
I-233	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.736	2	332.2
I-234	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	0.962	2	330.5
I-235	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-CH ₂ SCH ₂ -		H	0.741	2	304.1
I-236	O	N	H	CH ₃	2-CH ₃ -1,3-<OTL>-2	CH ₃	H	0.780	2	334.3
I-237	O	N	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -1,3-<OTL>-2	CH ₃	H	0.784	2	348.4
I-238	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -1,3-<OTL>-2	CH ₃	H	0.827	2	362.5

編號	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理數據 (HPLC / MS)		
								RT [min]	方法	m/z [MH] ⁺
I-239	O	C	H	CH ₃	2-CH ₃ -1,3-<OTL>-2	CH ₃	H	0.762	2	333.3
I-240	O	C	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -1,3-<OTL>-2	CH ₃	H	0.750	2	347.3
I-241	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -1,3-<OTL>-2	CH ₃	H	0.779	2	361.3
I-242	O	N	H	CH ₃	-CH ₂ S(O)CH ₂ -		H	0.507	2	292.2
I-243	O	N	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ S(O)CH ₂ -		H	0.487	2	306.2
I-244	O	C	CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₃	0.668	2	284.0
I-245	O	C	H	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₃	0.663	2	270.3
I-246	O	N	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.790	2	346.2
I-247	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.834	2	360.2
I-248	O	N	H	CH ₃	CH(CH ₃)CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.777	2	332.1
I-249	O	N	H	CH ₃	<TP>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.815	2	330.4
I-250	O	N	CH ₃	CH ₃	<TP>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.823	2	344.4
I-251	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	<TP>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.870	2	358.5
I-252	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	<TP>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.849	2	357.4
I-253	O	C	H	CH ₃	<TP>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.801	2	329.4
I-254	O	C	CH ₃	CH ₃	<TP>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.788	2	343.4
I-255	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-CH ₂ S(O)CH ₂ -		H	0.573	2	320.2
I-256	O	C	H	CH ₃	-CH ₂ S(O)CH ₂ -		H	0.488	2	291.2
I-257	O	N	H	CH ₃	C(O)NHCH ₃	CH ₃	H	0.535	2	289.0
I-258	O	N	H	CH ₃	CH(CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.987	2	316.5
I-259	O	N	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.987	2	330.4
I-260	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH(CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	1.035	2	344.6
I-261	O	C	H	CH ₃	CH(CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.946	2	315.4
I-262	O	C	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.959	2	329.5

編號	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理數據 (HPLC / MS)	
								RT [min]	m/z [MH] ⁺
I-263	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH(CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	1.024	343.6
I-264	O	N	H	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.875	288.3
I-265	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.868	302.3
I-266	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.915	316.2
I-267	O	C	H	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.841	287.4
I-268	O	C	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.835	301.4
I-269	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.899	315.4
I-270	O	N	CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.706	318.1
I-271	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.758	332.2
I-272	O	C	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.707	331.2
I-273	O	C	CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.680	317.2
I-274	O	N	H	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.708	304.1
I-275	O	C	H	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.693	303.1
I-276	O	N	H	CH ₃	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	0.850	328.1
I-277	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	0.859	342.0
I-278	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	0.917	356.1
I-279	O	C	H	CH ₃	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	0.834	327.3
I-280	O	C	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	0.842	341.2
I-281	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	0.903	355.3
I-282	O	N	H	CH ₃	3-<TN>	CH ₃	H	0.740	314.4
I-283	O	N	CH ₃	CH ₃	3-<TN>	CH ₃	H	0.791	328.1
I-284	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-<TN>	CH ₃	H	0.847	342.1
I-285	O	C	H	CH ₃	3-<TN>	CH ₃	H	0.783	313.4
I-286	O	C	CH ₃	CH ₃	3-<TN>	CH ₃	H	0.768	327.3

編號	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理數據 (HPLC / MS)		
								RT [min]	方法	m/z [MH] ⁺
I-287	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-<TN>	CH ₃	H	0.830	2	341.3
I-288	O	N	CH ₃	CH ₃	C(O)NHCH ₃	CH ₃	H	0.529	2	303.3
I-289	O	C	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N[C(O)CH ₃]CH ₂ CH ₂ -		H	0.610	2	328.3
I-290	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	c-C ₃ H ₅	H	0.838	2	353.4
I-291	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₆ H ₅	CH ₃	H	0.893	2	352.4
I-292	O	N	H	CH ₃	CH ₂ OC ₆ H ₅	CH ₃	H	0.885	2	338.3
I-293	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₆ H ₅	CH ₃	H	0.931	2	366.6
I-294	O	C	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₆ H ₅	CH ₃	H	0.863	2	351.3
I-295	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₆ H ₅	CH ₃	H	0.912	2	365.4
I-296	O	C	H	CH ₃	CH ₂ OC ₆ H ₅	CH ₃	H	0.859	2	337.4
I-297	O	N	H	CH ₃	CF ₃	c-C ₃ H ₅	H	0.826	2	326.2
I-298	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₃	c-C ₃ H ₅	H	0.827	2	340.3
I-299	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	c-C ₃ H ₅	H	0.873	2	354.3
I-300	O	C	H	CH ₃	CF ₃	c-C ₃ H ₅	H	0.796	2	325.2
I-301	O	C	CH ₃	CH ₃	CF ₃	c-C ₃ H ₅	H	0.781	2	339.0
I-302	O	C	H	CH ₃	C(O)NHCH ₃	CH ₃	H	1.197	1	288.1
I-303	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(O)NHCH ₃	CH ₃	H	0.601	2	317.1
I-304	O	N	H	CH ₃	1-S(O) ₂ CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.661	2	350.1
I-305	O	N	CH ₃	CH ₃	1-S(O) ₂ CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.665	2	364.1
I-306	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-S(O) ₂ CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.719	2	378.1
I-307	O	C	H	CH ₃	1-S(O) ₂ CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.653	2	349.1
I-308	O	C	CH ₃	CH ₃	1-S(O) ₂ CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.651	2	363.0
I-309	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-S(O) ₂ CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.706	2	377.2
I-310	O	C	CH ₃	CF ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	2.877	1	355.1

編號	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理數據 (HPLC/MS)		
								RT [min]	方法	m/z [MH] ⁺
I-311	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.730	2	331.2
I-312	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.764	2	345.2
I-313	O	N	H	CH ₃	1,1-<DOT>-3	CH ₃	H	0.603	2	336.0
I-314	O	N	CH ₃	CH ₃	1,1-<DOT>-3	CH ₃	H	0.574	2	350.0
I-315	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1,1-<DOT>-3	CH ₃	H	0.666	2	364.0
I-316	O	C	H	CH ₃	1,1-<DOT>-3	CH ₃	H	0.584	2	335.0
I-317	O	C	CH ₃	CH ₃	1,1-<DOT>-3	CH ₃	H	0.544	2	349.0
I-318	O	N	H	CH ₃	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.816	2	286.2
I-319	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.870	2	314.2
I-320	O	C	H	CH ₃	1-CH ₃ -o-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.790	2	285.2
I-321	O	C	CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.768	2	299.2
I-322	O	N	CH ₃	CH ₃	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	H	0.827	2	354.1
I-323	O	N	H	CH ₃	1,3-<DT>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.840	2	364.3
I-324	O	N	CH ₃	CH ₃	1,3-<DT>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.837	2	378.4
I-325	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-<DT>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.889	2	392.3
I-326	O	C	H	CH ₃	1,3-<DT>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.817	2	363.3
I-327	O	C	CH ₃	CH ₃	1,3-<DT>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.812	2	377.4
I-328	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-<DT>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.873	2	391.4
I-329	O	N	H	CH ₃	CH ₂ OH	CH ₃	H	0.522	2	262.0
I-330	O	N	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N[C(O)CH ₃]CH ₂ CH ₂ -	CH ₃	H	0.624	2	329.1
I-331	O	N	H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.849	2	346.1
I-332	O	N	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.854	2	360.5
I-333	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.908	2	374.4
I-334	O	N	H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	H	0.695	2	299.0

編號	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理數據 (HPLC / MS)	
								RT [min]	m/z [MH] ⁺
I-335	O	N	H	CH ₃	<TT>-3	CH ₃	H	0.745	304.0
I-336	O	N	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	H	0.698	313.1
I-337	O	N	CH ₃	CH ₃	<TT>-3	CH ₃	H	0.751	318.0
I-338	O	C	CH ₃	CH ₃	<TT>-3	CH ₃	H	0.724	317.0
I-339	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	H	0.754	327.2
I-340	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-<OTT>-3	CH ₃	H	0.635	348.0
I-341	O	N	H	CH ₃	<TZ>-2	CH ₃	H	0.680	315.0
I-342	O	N	CH ₃	CH ₃	<TZ>-2	CH ₃	H	0.678	329.0
I-343	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	<TZ>-2	CH ₃	H	0.726	343.1
I-344	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H	0.808	342.1
I-345	O	N	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H	0.760	314.1
I-346	O	N	CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.817	300.2
I-347	O	C	CH ₃	CH ₃	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	H	0.795 (S)	353.1
I-348	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	H	0.883 (S)	368.1
I-349	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	H	0.848 (S)	367.1
I-350	O	N	H	CH ₃	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	H	0.831	340.1
I-351	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H	0.752	328.1
I-352	O	N	H	CH ₃	1-SCH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.820	318.0
I-353	O	N	CH ₃	CH ₃	1-SCH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.816	332.0
I-354	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-SCH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.873	346.0
I-355	O	C	H	CH ₃	1-SCH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.785	317.0
I-356	O	C	CH ₃	CH ₃	1-SCH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.793	331.0
I-357	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-SCH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.849	345.2
I-358	O	C	H	CH ₃	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	H	0.801	339.1

編號	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理數據 (HPLC / MS)		
								RT [min]	方法	m/z [MH] ⁺
I-359	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -o-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.828 (S)	2	313.2
I-360	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	C(CH ₃) ₃	H	0.986	2	370.3
I-361	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₃	C(CH ₃) ₃	H	0.926	2	356.5
I-362	O	N	H	CH ₃	CF ₃	C(CH ₃) ₃	H	0.909	2	342.4
I-363	O	N	H	CH ₃	1-CF ₃ -o-C ₃ H ₄	CH ₃	H	2.417	1	340.1
I-364	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-CF ₃ -o-C ₃ H ₄	CH ₃	H	2.535	1	368.2
I-365	O	N	CH ₃	CH ₃	1-CF ₃ -o-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.865	2	354.1
I-366	O	N	H	CH ₃	o-C ₃ H ₅	CH ₃	H	2.047	1	272.1
I-367	O	N	CH ₃	CH ₃	o-C ₃ H ₅	CH ₃	H	2.028	1	286.2
I-368	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	0.728	2	314.1
I-369	O	N	H	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	2.025	1	300.1
I-370	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	0.798	2	328.1
I-371	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	o-C ₃ H ₅	CH ₃	H	2.133	1	316.2
I-372	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	2.483	1	344.1
I-373	O	C	CH ₃	CH ₃	o-C ₃ H ₅	CH ₃	H	1.801	1	285.1
I-374	O	C	H	CH ₃	o-C ₃ H ₅	CH ₃	H	1.965	1	271.1
I-375	O	C	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	o-C ₃ H ₅	CH ₃	H	1.954	1	315.1
I-376	O	C	H	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	1.889	1	299.0
I-377	O	C	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	1.768	1	313.1
I-378	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	o-C ₃ H ₅	CH ₃	H	1.976	1	299.2
I-379	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	1.927	1	327.1
I-380	O	C	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	0.776	2	343.0
I-381	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	9.0 (E+)	3	
I-382	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	10.7 (E-)	3	

編號	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理數據 (HPLC / MS)		
								RT [min]	方法	m/z [MH] ⁺
I-383	O	N	CH ₃	CH ₃	o-C ₃ H ₅	CH ₃	H	12.1 (E-)	4	
I-384	O	N	CH ₃	CH ₃	o-C ₃ H ₅	CH ₃	H	13.5 (E+)	4	

縮寫：

- <DOT>：二側氧基硫雜環丁基 <OTT>：側氧基硫雜環丁基 <TP>：四氫吡喃基
- <DT>：二噻烷基 <PY>：吡啶基 <TT>：硫雜環丁基
- <OTL>：氧硫雜環戊基 <TN>：噻吩基 <TZ>：噻唑基

- (A)、(B)：分別為非對映異構體A及B
- (S)：三氟乙酸鹽
- (E+)：(+)-對映異構體
- (E-)：(-)-對映異構體

B. 生物學實例

可在下文所述生物學測試中證實並評價本發明式I化合物之活性。

若未另外說明，則測試溶液如下製備：

將活性化合物以期望濃度溶於1:1 (體積:體積)蒸餾水:丙酮之混合物中。在使用當天且一般以ppm (wt/vol)濃度製備測試溶液。

B.1 豇豆蚜(豆蚜(*Aphis craccivora*))

在記錄害蟲種群後對移居有100至150只蚜蟲之不同階段之盆栽豇豆植物實施噴霧。在24、72及120小時後評估種群減少。

在此測試中，與未經處理之對照相比，化合物I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-25、I-26、I-27、I-28、I-29、I-30、I-31、I-32、I-33、I-34、I-35、I-36、I-37、I-38、I-39、I-40、I-41、I-42、I-43、I-44、I-45、I-46、I-47、I-48、I-50、I-51、I-52、I-53、I-54、I-55、I-56、I-57、I-58、I-59、I-60、I-61、I-62、I-63、I-64、I-65、I-66、I-67、I-68、I-69、I-70、I-71、I-72、I-74、I-75、I-76、I-77、I-78、I-79、I-80、I-81、I-82、I-83、I-84、I-85、I-86、I-87、I-88、I-91、I-92、I-93、I-94、I-95、I-96、I-97、I-98、I-99、I-100、I-101、I-102、I-103、I-104、I-105、I-106、I-107、I-108、I-109、I-110、I-111、I-112、

I-113 、 I-114 、 I-115 、 I-116 、 I-117 、 I-118 、 I-119 、 I-120 、 I-121 、 I-122 、 I-123 、 I-124 、 I-125 、 I-126 、 I-127 、 I-128 、 I-129 、 I-130 、 I-131 、 I-132 、 I-133 、 I-134 、 I-135 、 I-136 、 I-137 、 I-138 、 I-139 、 I-140 、 I-141 、 I-142 、 I-143 、 I-144 、 I-145 、 I-146 、 I-147 、 I-148 、 I-149 、 I-150 、 I-151 、 I-152 、 I-153 、 I-154 、 I-155 、 I-156 、 I-157 、 I-158 、 I-159 、 I-160 、 I-161 、 I-162 、 I-163 、 I-164 、 I-166 、 I-167 、 I-168 、 I-169 、 I-170 、 I-171 、 I-172 、 I-173 、 I-174 、 I-175 、 I-176 、 I-177 、 I-178 、 I-179 、 I-180 、 I-181 、 I-182 、 I-183 、 I-184 、 I-185 、 I-186 、 I-187 、 I-188 、 I-189 、 I-190 、 I-191 、 I-192 、 I-193 、 I-194 、 I-195 、 I-196 、 I-197 、 I-198 、 I-199 、 I-200 、 I-201 、 I-202 、 I-203 、 I-204 、 I-205 、 I-211 、 I-212 、 I-214 、 I-215 、 I-216 、 I-218 、 I-219 、 I-220 、 I-221 、 I-222 、 I-223 、 I-224 、 I-230 、 I-231 、 I-232 、 I-233 、 I-235 、 I-236 、 I-237 、 I-238 、 I-239 、 I-240 、 I-241 、 I-244 、 I-245 、 I-246 、 I-247 、 I-249 、 I-250 、 I-251 、 I-252 、 I-253 、 I-254 、 I-255 、 I-256 、 I-257 、 I-258 、 I-259 、 I-260 、 I-261 、 I-262 、 I-263 、 I-264 、 I-265 、 I-266 、 I-267 、 I-268 、 I-269 、 I-270 、 I-271 、 I-272 、 I-273 、 I-274 、 I-275 、 I-276 、 I-277 、 I-278 、 I-279 、 I-280 、 I-281 、 I-282 、 I-283 、 I-284 、 I-285 、 I-286 、 I-287 、 I-288 、 I-289 、 I-290 、 I-291 、 I-292 、 I-293 、 I-294 、 I-295 、 I-296 、 I-297 、 I-298 、 I-299 、 I-300 、 I-301 、 I-302 、 I-303 、 I-304 、 I-305 、 I-306 、 I-307 、 I-308 、 I-309 、

I-310、I-311、I-312、I-313、I-314、I-315、I-316、I-317、I-366、I-367、I-368、I-369、I-370、I-371、I-372、I-373、I-374、I-375、I-376、I-377、I-378、I-379、I-380、I-381、I-382、I-383及I-384在500 ppm下顯示至少75%之死亡率。

B.2棉蚜(Cotton aphid, *Aphis gossypii*, 混合生命期)

在環己酮中將活性化合物調配為10,000 ppm溶液，供應於1.3 ml ABgene®管中。此等管插入安裝有霧化噴嘴之自動靜電噴霧器中且其充當儲備液，用於在1:1 (體積：體積)水:丙酮中製成更低濃度之稀釋液。將非離子型表面活性劑(Kinetic®)以0.01% (v/v)體積納入溶液中。

在處理前，藉由將來自主要蚜蟲群落之受嚴重侵擾之葉置於每一子葉之頂部上以使子葉期棉花植物受蚜蟲侵擾。使蚜蟲轉移過夜以達成每株植物受80至100個蚜蟲侵擾並移走宿主葉。然後藉由安裝有霧化噴嘴之自動靜電植物噴霧器對受侵擾植物實施噴霧。在噴霧器通風櫥中乾燥植物，將其移離噴霧器，且然後在25°C及20-40%相對濕度下在24小時光週期中在螢光照明下將其維持在生長室中。5天後，相對於未經處理之對照植物上蚜蟲之死亡率測定經處理植物上之死亡率。

在此測試中，與未經處理之對照相比，化合物I-1、I-4、I-5、I-6、I-7、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-26、I-27、I-28、I-29、I-30、I-31、I-32、I-33、I-35、I-

36、I-38、I-39、I-42、I-43、I-44、I-45、I-46、I-47、I-48、I-51、I-60、I-61、I-62、I-63、I-64、I-66、I-67、I-75、I-76、I-77、I-78、I-79、I-80、I-81、I-83、I-85、I-87、I-88、I-90、I-91、I-92、I-93、I-94、I-95、I-96、I-97、I-98、I-99、I-100、I-101、I-102、I-103、I-104、I-105、I-106、I-107、I-109、I-112、I-114、I-115、I-116、I-117、I-118、I-119、I-120、I-121、I-125、I-129、I-131、I-133、I-134、I-135、I-136、I-137、I-138、I-140、I-141、I-142、I-143、I-144、I-145、I-147、I-148、I-149、I-150、I-151、I-152、I-155、I-157、I-166、I-167、I-168、I-169、I-170、I-173、I-174、I-181、I-182、I-183、I-184、I-185、I-186、I-188、I-189、I-190、I-191、I-192、I-193、I-195、I-196、I-197、I-198、I-199、I-200、I-201、I-202、I-203、I-204、I-205、I-211、I-212、I-232、I-233、I-238、I-265、I-271、I-277、I-290、I-300、I-302、I-307、I-366、I-367、I-368、I-369、I-370、I-371、I-372、I-373、I-374、I-375、I-376、I-377、I-378、I-379、I-380、I-381、I-382、I-383及I-384在10 ppm下顯示至少75%之死亡率。

B.3銀葉粉虱(Silverleaf whitefly, *Bemisia argentifolii*, 成蟲)

在環己酮中將活性化合物調配為10,000 ppm溶液，供應於1.3 ml ABgene®管中。此等管插入安裝有霧化噴嘴之自動靜電噴霧器中且其充當儲備液，用於在1:1（體積：體

積)水:丙酮中製成更低濃度之稀釋液。將非離子型表面活性劑(Kinetic®)以0.01% (v/v)體積納入溶液中。

藉由安裝有霧化噴嘴之自動靜電植物噴霧器對子葉期棉花植物(1株植物/盆)實施噴霧。在噴霧器通風櫥中乾燥植物且然後將其移離噴霧器。將每一盆置於塑膠杯中並引入10至12只粉虱成蟲(約3至5日齡)。使用抽吸器及連接至障壁移液管尖端之0.6 cm無毒Tygon®管(R-3603)收集昆蟲。然後，將含有所收集昆蟲之尖端輕輕插入含有經處理植物之土壤中，使昆蟲爬出尖端到達供飼餵葉片上。用可重複使用之篩網蓋(150微米網目之聚酯篩網PeCap，購自Tetko公司)覆蓋杯子。在25°C及20-40%相對濕度下將測試植物在生長室中維持3天，避免直接暴露於螢光燈(24小時光週期)下以防止杯內熱量截留。在處理後3天評估死亡率，將其與未經處理之對照植物進行比較。

在此測試中，與未經處理之對照相比，化合物I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-18、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-27、I-28、I-29、I-30、I-31、I-32、I-33、I-35、I-39、I-43、I-46、I-61、I-63、I-67、I-68、I-76、I-79、I-85、I-87、I-88、I-90、I-91、I-92、I-93、I-94、I-96、I-97、I-98、I-102、I-103、I-104、I-105、I-109、I-113、I-115、I-128、I-129、I-133、I-135、I-137、I-138、I-139、I-142、I-143、I-144、I-145、I-146、I-148、I-149、I-153、I-155、I-157、I-167、I-168、I-169、I-173、I-177、I-181、I-182、I-183、

I-184、I-188、I-190、I-198、I-201、I-202、I-204、I-238、I-260、I-266、I-277、I-292、I-366、I-367、I-368、I-369、I-370、I-371、I-372、I-376、I-377、I-379及I-380在10 ppm下顯示至少75%之死亡率。

B.4 巢菜修尾蚜(Vetch aphid, *Megoura viciae*)

在3:1 (體積:體積)水:DMSO中以不同經調配化合物濃度調配活性化合物。

將豆葉盤置於填充有0.8%瓊脂及2.5 ppm OPUS™之微量滴定板中。用2.5 µl測試溶液噴霧葉盤並將5至8只成年蚜蟲置於微量滴定板中，然後封閉微量滴定板並在 $23 \pm 1^\circ\text{C}$ 及 $50 \pm 5\%$ 之相對濕度下於螢光燈下保持6天。基於存活且繁殖之蚜蟲評估死亡率。然後目測評價蚜蟲之死亡率及繁殖力。

在此測試中，與未經處理之對照相比，化合物I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-25、I-26、I-27、I-28、I-29、I-30、I-31、I-32、I-33、I-34、I-35、I-36、I-38、I-41、I-42、I-43、I-44、I-45、I-46、I-47、I-48、I-49、I-50、I-51、I-52、I-53、I-54、I-55、I-57、I-58、I-59、I-60、I-61、I-62、I-63、I-64、I-65、I-66、I-67、I-68、I-69、I-70、I-71、I-72、I-74、I-75、I-76、I-77、I-78、I-79、I-80、I-81、I-82、I-83、I-84、I-85、I-86、I-87、I-88、I-91、I-92、I-93、I-94、I-95、I-96、I-97、I-98、I-99、I-

100、I-101、I-102、I-103、I-104、I-105、I-106、I-107、I-108、I-109、I-112、I-113、I-114、I-115、I-116、I-117、I-118、I-119、I-120、I-121、I-122、I-123、I-124、I-125、I-126、I-127、I-128、I-129、I-130、I-131、I-132、I-133、I-134、I-135、I-136、I-137、I-138、I-140、I-141、I-142、I-143、I-144、I-145、I-146、I-152、I-154、I-155、I-156、I-157、I-158、I-159、I-161、I-162、I-163、I-164、I-165、I-166、I-173、I-174、I-181、I-182、I-183、I-184、I-185、I-194、I-195、I-196、I-197、I-218、I-219、I-220、I-221、I-222、I-223、I-224、I-225、I-226、I-227、I-228、I-229、I-230、I-231、I-232、I-233、I-234、I-242、I-244、I-245、I-246、I-247、I-248、I-256、I-270、I-271、I-272、I-273、I-274、I-275、I-289、I-304、I-305、I-306、I-307、I-308、I-309、I-311、I-312、I-366、I-367、I-368、I-369、I-370、I-371、I-372、I-373、I-374、I-375、I-376、I-377、I-378、I-379、I-380、I-381、I-382、I-383及I-384在2500 ppm下顯示至少75%之死亡率。

B.5 桃蚜 (Green peach aphid, *Myzus persicae*)

在環己酮中將活性化合物調配為10,000 ppm溶液，供應於1.3 ml ABgene®管中。此等管插入安裝有自動噴嘴之自動靜電噴霧器中且其充當儲備液，用於在1:1 (體積：體積)水:丙酮中製成更低濃度之稀釋液。將非離子型表面活性劑(Kinetic®)以0.01% (v/v)體積納入溶液中。

在處理前藉由將來自主要群落之受嚴重侵擾之葉置於處理植物頂部上來侵擾第一真葉期甜椒(Bell pepper)植物。使蚜蟲轉移過夜以達成每株植物30至50只蚜蟲受侵擾並移走宿主葉。然後藉由安裝有霧化噴嘴之自動靜電植物噴霧器對侵擾植物實施噴霧。在噴霧器通風櫥中乾燥植物，移走，且然後在25℃及20-40%相對濕度下在24小時光週期中在螢光照明下使其維持在生長室中。5天後，相對於對照植物上蚜蟲之死亡率測定經處理植物上之死亡率。

在此測試中，與未經處理之對照相比，化合物I-1、I-2、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-27、I-28、I-29、I-30、I-31、I-32、I-33、I-34、I-35、I-36、I-37、I-38、I-39、I-42、I-43、I-44、I-45、I-46、I-47、I-48、I-50、I-60、I-61、I-62、I-63、I-64、I-66、I-67、I-69、I-71、I-74、I-75、I-76、I-77、I-78、I-79、I-80、I-81、I-82、I-83、I-84、I-85、I-86、I-87、I-88、I-89、I-90、I-91、I-92、I-93、I-94、I-95、I-96、I-97、I-98、I-99、I-100、I-101、I-102、I-103、I-104、I-105、I-106、I-107、I-108、I-109、I-110、I-111、I-112、I-114、I-115、I-116、I-117、I-118、I-120、I-121、I-124、I-125、I-126、I-127、I-128、I-129、I-130、I-131、I-132、I-133、I-134、I-135、I-136、I-137、I-138、I-140、I-141、I-142、I-143、I-144、I-145、I-146、I-147、I-148、I-149、I-150、I-151、I-152、I-

I-153、I-155、I-157、I-167、I-168、I-169、I-170、I-173、I-174、I-176、I-177、I-181、I-183、I-184、I-185、I-186、I-188、I-189、I-190、I-191、I-192、I-193、I-194、I-195、I-196、I-197、I-198、I-199、I-200、I-201、I-202、I-203、I-204、I-205、I-211、I-212、I-232、I-238、I-251、I-265、I-266、I-271、I-277、I-284、I-288、I-290、I-291、I-292、I-293、I-300、I-302、I-303、I-307、I-366、I-367、I-368、I-369、I-370、I-371、I-372、I-373、I-374、I-375、I-376、I-377、I-378、I-379、I-380、I-381、I-382、I-383及I-384在10 ppm下顯示至少75%之死亡率。

B.6 棉鈴象甲(Boll weevil, *Anthonomus grandis*)

在3:1 (體積:體積)水:DMSO中調配化合物。

為評價棉子棉鈴象甲(boll weevil, *Anthonomus grandis*)之控制，測試單元由含有昆蟲餌料及20-30只棉鈴象甲卵之24孔微量滴定板組成。使用定製微量噴霧器以20 µl之量將不同濃度之經調配化合物或混合物噴霧至昆蟲餌料上，並重複兩次。施加後，在 $23\pm1^{\circ}\text{C}$ 及 $50\pm5\%$ 相對濕度下將微量滴定板培育5天。然後目測評價卵及幼蟲之死亡率。

在此測試中，與未經處理之對照相比，化合物I-67、I-85、I-92、I-94、I-95、I-96、I-98、I-102、I-104、I-113、I-127、I-132、I-137、I-143、I-182、I-374、I-377及I-380在2500 ppm下顯示至少75%之死亡率。

B.7 褐稻虱(Rice plant hopper, *Nilaparvata lugens*)

在噴霧前將稻幼苗清潔並洗滌24小時。在1:1 (體積:體積)水:丙酮中調配活性化合物並添加0.1% (體積/體積)表面活性劑(EL 620)。用5 ml測試溶液噴霧盆栽稻幼苗，風乾，將其置於籠中並用10只成蟲實施接種。將經處理稻植物保持在28-29℃及50-60%之相對濕度下。在72小時後記錄百分比死亡率。

在此測試中，與未經處理之對照相比，化合物I-8、I-9、I-10、I-11、I-25、I-29、I-35、I-62、I-63、I-68、I-113、I-141、I-143、I-199、I-204、I-245、I-312及I-371在500 ppm下顯示至少75%之死亡率。

B.8 蘭花薊馬(Orchid thrips, *Dichromothrips corbetti*)

將活性化合物調配為1:1 (體積:體積)水:丙酮溶液。以0.1% (體積/體積)之比率添加表面活性劑(Alkamuls EL 620)。在噴霧前，將蝴蝶蘭(*Vanda orchids*)花瓣清潔，洗滌並風乾。將花瓣浸於測試溶液中3秒，風乾，置於可重新密封之塑膠內部並用20只成蟲實施接種。在28-29℃及50-60%相對濕度下將經處理花瓣保持在保存室內部。在72小時後記錄百分比死亡率。

在此測試中，與未經處理之對照相比，化合物I-4、I-35、I-39、I-43、I-78、I-83、I-86、I-94、I-95、I-96、I-107、I-109、I-115、I-132、I-133、I-142、I-143、I-146、I-154、I-158、I-168、I-184、I-186、I-187、I-189、I-191、I-193、I-198、I-201、I-202、I-203、I-204、I-205、I-278、I-279、I-280、I-281、I-297、I-298、I-299、I-

300、I-305、I-306、I-308、I-310、I-370及I-373在500 ppm下顯示至少75%之死亡率。

B.9 二點黑尾葉蟬 (Rice green leafhopper, *Nephotettix virescens*)

在噴霧前將稻幼苗清潔並洗滌24小時。在1:1 (體積:體積)水:丙酮中調配活性化合物，並添加0.1%體積/體積表面活性劑(EL 620)。用5 ml測試溶液噴霧盆栽稻幼苗，風乾，將其置於籠中並用10只成蟲實施接種。將經處理稻植物保持在28-29°C及50-60%之相對濕度下。在72小時後記錄百分比死亡率。

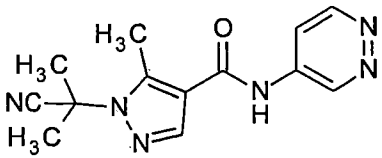
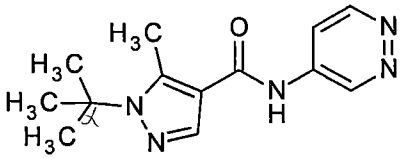
在此測試中，與未經處理之對照相比，化合物I-7、I-8、I-10、I-11、I-32、I-33、I-63、I-79、I-113及I-199在500 ppm下顯示至少75%之死亡率。

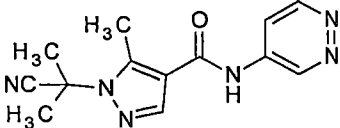
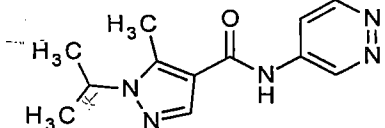
B.10 小菜蛾 (Diamondback moth, *Plutella xylostella*)

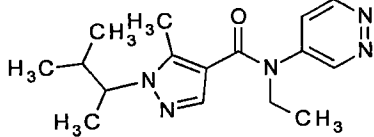
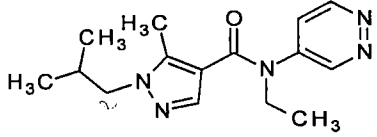
在1:1 (體積:體積)水:丙酮及0.1% (體積:體積)Alkamuls EL 620表面活性劑中調配活性化合物。將6 cm甘藍葉之葉盤浸於測試溶液中3秒並使其在與潤濕濾紙對齊之Petri板中風乾。用10只第三齡幼蟲對葉盤實施接種並在25°C至27°C及50-60%濕度下保持3天。在處理72 h後評估死亡率。

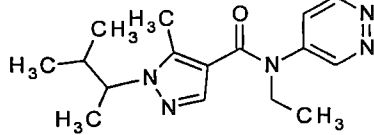
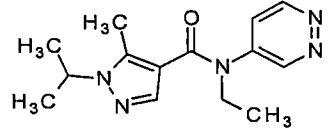
藉由以下比較實驗來證實本發明化合物之有益活性優於先前技術已知之在結構上類似之化合物：

該等表顯示與未經處理之對照相比之%死亡率。

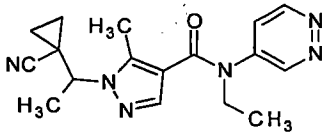
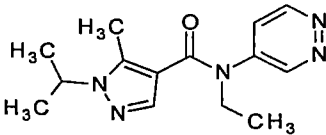
化合物		
測試/濃度	編號I-32	WO10/034737中表14編號7
B.1/0.3 ppm	100%	0%
B.2/3 ppm	90%	25%

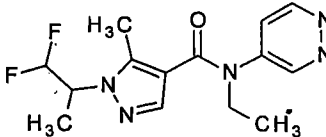
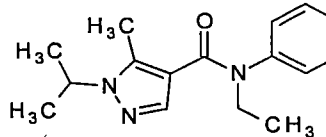
化合物		
測試/濃度	編號I-32	WO10/034737中表14編號5
B.3/1 ppm	100%	0%
B.9/500 ppm	75%	0%

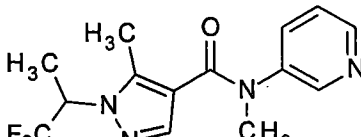
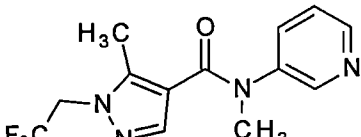
化合物		
測試/濃度	編號I-98	WO10/034737中編號175
B.1/0.3 ppm	75%	0%
B.2/0.1 ppm	95%	0%
B.5/0.1 ppm	95%	0%

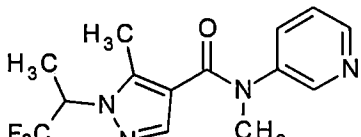
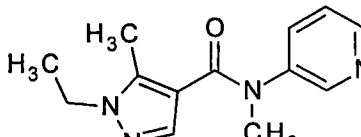
化合物		
測試/濃度	編號I-98	WO10/034737中表98編號5
B.3/3 ppm	75%	0%
B.10/500 ppm	25% FD*)	100% FD*)

*) FD = 食害

化合物		
測試/濃度	編號I-198	WO10/034737 中表98編號5
B.3/1 ppm	100%	0%
B.8/500 ppm	75%	0%

化合物		
測試/濃度	編號I-201	WO 10/034737 中表98編號5
B.3/1 ppm	100%	0%
B.8/500 ppm	63%	0%

化合物		
測試/濃度	編號I-377	WO 09/027393 中編號173
B.3/10 ppm	75%	25%
B.5/10 ppm	100%	50%

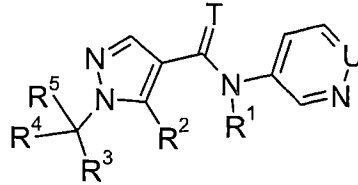
化合物		
測試/濃度	編號I-377	WO 09/027393 中編號180
B.3/100 ppm	100%	0%

公告本

105年(2月)9日: 修正
補充

七、申請專利範圍：

1. 一種新穎之式I吡唑化合物或其立體異構體、鹽、互變異構體或N-氧化物，



其中

U 係 N 或 CH；

T 係 O 或 S；

R¹ 係 H、C₁-C₂-烷基或 C₁-C₂-烷氧基-C₁-C₂-烷基；

R² 係 CH₃或鹵甲基；

R³ 係 C₂-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵烷基、C₁-C₂-烷氧基-C₁-C₂-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-環烷基、C₅-C₆-環烯基、C₁-C₆-烷氧基、CN、NO₂或 S(O)_nR^b，其中 C 原子可未經取代，或部分地或完全經 R^a取代；

R^a 係鹵素、CN、NO₂、C₁-C₂-烷基、C₁-C₂-鹵烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₂-鹵烷氧基或 S(O)_nR^b；

n 係 0、1 或 2；

R^b 係氫、C₁-C₂-烷基、C₁-C₂-鹵烷基、C₃-C₆-環烷基或 C₁-C₄-烷氧基，

R⁴ 係甲基或針對 R³所提及之基團；

R^5 係 H 或針對 R^4 所提及之基團；

R^3 及 R^4 可一起形成飽和之三至六員碳環或雜環，其可含有 1 或 2 個選自 N- R^c 、O 及 S 之雜原子，其中 S 可經氧化，該碳環或雜環可經 R^a 取代；且

R^c 係氫、 C_1 - C_2 -烷基、 C_1 - C_2 -鹵烷基、 C_1 - C_2 -烷基羰基或 C_1 - C_2 -烷氧基羰基。

2. 如請求項 1 之式 I 化合物或其立體異構體、鹽、互變異構體或 N-氧化物，其中 U 係 CH。
3. 如請求項 1 之式 I 化合物或其立體異構體、鹽、互變異構體或 N-氧化物，其中 U 係 N。
4. 如請求項 1 之式 I 化合物或其立體異構體、鹽、互變異構體或 N-氧化物，其中 T 係 O。
5. 如請求項 1 至 4 中任一項之式 I 化合物或其立體異構體、鹽、互變異構體或 N-氧化物，其中 R^1 係 H、 C_1 - C_2 -烷基或 C_1 - C_2 -烷氧基甲基。
6. 如請求項 1 至 4 中任一項之式 I 化合物或其立體異構體、鹽、互變異構體或 N-氧化物，其中 R^2 係 CH_3 、 CHF_2 或 CF_3 。
7. 如請求項 1 至 4 中任一項之式 I 化合物或其立體異構體、鹽、互變異構體或 N-氧化物，其中 R^3 係 CN、 C_2 - C_6 -烷基、 C_1 - C_2 -鹵烷基、 C_1 - C_2 -烷氧基- C_1 - C_2 -烷基或 C_3 - C_6 -環烷基，其中該等 C 原子可經取代。
8. 如請求項 1 至 4 中任一項之式 I 化合物或其立體異構體、鹽、互變異構體或 N-氧化物，其中 R^4 係 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 -

C₄-鹵烷基或C₃-C₆-環烷基，其中該等C原子可經取代。

9. 如請求項1至4中任一項之式I化合物或其立體異構體、鹽、互變異構體或N-氧化物，其中R⁵係H或CH₃。
10. 如請求項1之式I化合物或其立體異構體、鹽、互變異構體或N-氧化物，其係選自下列：

化合物 編號	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
32	O	N	H	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₃
98	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H
198	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₃	H
201	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	H
377	O	C	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H

11. 一種組合物，其包含至少一種如請求項1至10中任一項之式I化合物或其立體異構體、鹽、互變異構體或N-氧化物及至少一種惰性液體及/或固體載劑。
12. 一種防治動物害蟲之農業組合物，其包含至少一種如請求項1至10中任一項之式I化合物或其立體異構體、鹽、互變異構體或N-氧化物及至少一種惰性液體及/或固體可接受之載劑。
13. 如請求項12之農業組合物，其進一步包含至少一種表面活性劑。
14. 一種防治或控制無脊椎害蟲之方法，該方法包含使該害蟲或其食物供應、棲息地或繁殖地與殺蟲有效量之至少一種如請求項1至10中任一項之式I化合物或其立體異構

體、鹽、互變異構體或N-氧化物接觸，其中該棲息地或繁殖地非人類或動物體。

15. 一種保護生長中植物免受無脊椎害蟲侵襲或侵擾之方法，該方法包含使植物或生長該植物之土壤或水與殺蟲有效量之至少一種如請求項1至10中任一項之式I化合物或其立體異構體、鹽、互變異構體或N-氧化物接觸。

16. 一種如請求項1至10中任一項之式I化合物或其立體異構體、鹽、互變異構體或N-氧化物之用途，其用於保護生長中植物免受無脊椎害蟲侵襲或侵擾。