



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201035025 A1

(43)公開日：中華民國 99 (2010) 年 10 月 01 日

(21)申請案號：098144385

(22)申請日：中華民國 98 (2009) 年 12 月 23 日

(51)Int. Cl.：

C07C317/28 (2006.01)

A01N41/10 (2006.01)

A01P7/00 (2006.01)

(30)優先權：2008/12/24

日本

2008-327877

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

日本

(72)發明人：光寺弘匡 MITSUDERA, HIROMASA (JP)

(74)代理人：洪武雄；陳昭誠

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：6 項 圖式數：0 共 108 頁

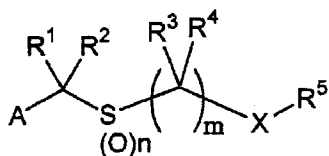
(54)名稱

含硫化合物及其用途

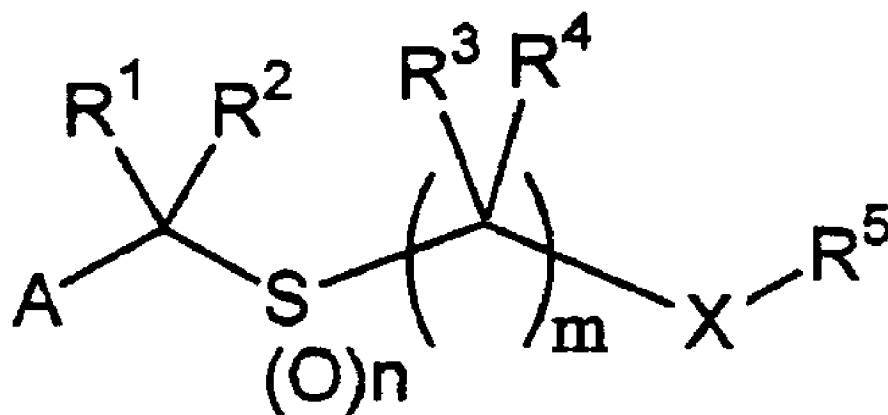
SULFUR-CONTAINING COMPOUND AND USE THEREOF

(57)摘要

本發明提供一種對節肢動物害蟲具有防治效果之式(I)所示之含硫化合物：



式中，m 表示 1、2 或 3；n 表示 0、1 或 2；A 表示視需要經取代之 C2-C10 氟烷基；R¹ 表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基、鹵素原子或氫原子；R² 表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基等；R³ 和 R⁴ 獨立表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基等；X 表示氧原子、硫原子、-SO-或-SO₂-；R⁵ 表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基等。





(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201035025 A1

(43)公開日：中華民國 99 (2010) 年 10 月 01 日

(21)申請案號：098144385

(22)申請日：中華民國 98 (2009) 年 12 月 23 日

(51)Int. Cl.：

C07C317/28 (2006.01)

A01N41/10 (2006.01)

A01P7/00 (2006.01)

(30)優先權：2008/12/24

日本

2008-327877

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

日本

(72)發明人：光寺弘匡 MITSUDERA, HIROMASA (JP)

(74)代理人：洪武雄；陳昭誠

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：6 項 圖式數：0 共 108 頁

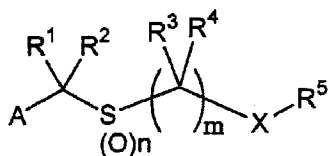
(54)名稱

含硫化合物及其用途

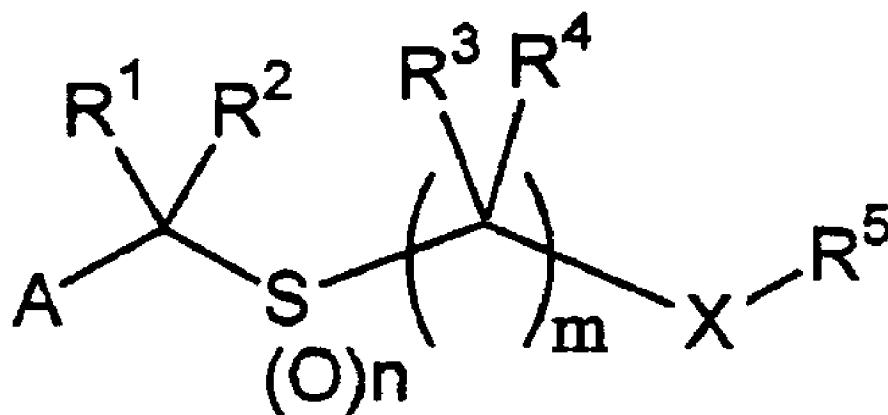
SULFUR-CONTAINING COMPOUND AND USE THEREOF

(57)摘要

本發明提供一種對節肢動物害蟲具有防治效果之式(I)所示之含硫化合物：



式中，m 表示 1、2 或 3；n 表示 0、1 或 2；A 表示視需要經取代之 C2-C10 氟烷基；R¹ 表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基、鹵素原子或氫原子；R² 表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基等；R³ 和 R⁴ 獨立表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基等；X 表示氧原子、硫原子、-SO-或-SO₂-；R⁵ 表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基等。



7

經選自群組 E 之基團取代之 C2-C10 氟烷基， R^1 表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基、鹵素原子或氫原子， R^2 表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基、 $-C(=G^1)R^6$ 、氰基或鹵素原子， R^3 和 R^4 獨立表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基、視需要經鹵化之苯基、鹵素原子或氫原子，且當 m 表示 2 或 3 時，兩個或更多個 R^3 可彼此相同或相異，以及兩個或更多個 R^4 可彼此相同或相異， X 表示氧原子、硫原子、 $-SO-$ 或 $-SO_2-$ ， R^5 表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基、 $-C(=G^2)R^7$ 、氰基或氫原子， G^1 和 G^2 獨立表示氧原子或硫原子， R^6 表示視需要經鹵化之 C1-C4 烷基、羥基、視需要經鹵化之 C1-C4 烷氧基、視需要經鹵化之 C3-C6 烯氧基、視需要經鹵化之 C3-C6 炔氧基、胺基、視需要經鹵化之 C1-C4 烷基胺基、視需要經鹵化之二(C1-C4 烷基)胺基、C2-C5 環胺基或氫原子， R^7 表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基，群組 E 係由 $-OR^8$ 、 $-SR^8$ 、 $-SO-R^8$ 、 $-SO_2-R^8$ 、氰基、羥基、氟原子以及溴原子所組成，以及 R^8 表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基；

(2) 如上述第(1)項之含硫化合物，其中， R^2 為 $-C(=G^1)R^6$ 或氰基；

(3) 如上述第(1)或(2)項之含硫化合物，其中， m 為 2；

(4) 如上述第(1)或(2)項之含硫化合物，其中， m 為 2，且 R^3 和 R^4 為氫原子；

(5) 一種節肢動物害蟲防治組成物，其包括上述第(1)至(4)項中任一項之含硫化合物作為活性成分；以及

(6) 一種用於防治節肢動物害蟲之方法，其包括將有效量

之上述第(1)至(4)項中任一項之含硫化合物施用至節肢動物害蟲或節肢動物害蟲之棲息地。

本發明之效果

本發明之化合物對節肢動物害蟲具有優異防治效果。

用以實行本發明之方式

舉例而言，本文所使用之“氟烷基”表示經一個或多個氟原子取代之烷基。本文所使用之用語“C1-C6”等表示構成各取代基之碳原子總數。

本文所使用之“鹵素原子”表示氟原子、氯原子、溴原子或碘原子。

在本發明化合物具有因不對稱碳原子(與 R^1 和 R^2 連接之不對稱碳原子或與 R^3 和 R^4 連接之不對稱碳原子)而產生之立體異構物的情況下，或在本發明化合物具有因烯基而產生之幾何異構物的情況下，本發明包含各個活性異構物以及由此等異構物以任何比率混合而成之活性混合物。

本文所使用之“視需要經選自群組 E 之基團取代之 C2-C10 氟烷基”中之 C2-C10 氟烷基之實例包含 C2 氟烷基如 2-氟乙基、2,2-二氟乙基、1,1,2,2-四氟乙基、1,1,2,2,2-五氟乙基以及 2,2,2-三氟乙基；C3 氟烷基如 2-氟丙基、2,2-二氟丙基、3-氟丙基、3,3-二氟丙基、3,3,3-三氟丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、2,2,3,3-四氟丙基以及 1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基；C4 氟烷基如 2-氟丁基、2,2-二氟丁基、3-氟丁基、3,3-二氟丁基、4-氟丁基、4,4-二氟丁基、4,4,4-三氟丁基、3,3,4,4,4-五氟丁基、2,2,3,

4, 4-五氟丁基、2, 2, 3, 3, 4, 4, 4-七氟丁基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4-八氟丁基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4, 4-九氟丁基、3, 3, 3-三氟-2-甲基丙基以及 2, 3, 3, 3-四氟-2-(三氟甲基)丙基；C5 氟烷基如 2-氟戊基、2, 2-二氟戊基、3-氟戊基、3, 3-二氟戊基、4-氟戊基、4, 4-二氟戊基、5-氟戊基、5, 5-二氟戊基、5, 5, 5-三氟戊基、4, 4, 5, 5, 5-五氟戊基、3, 3, 4, 4, 5, 5, 5-七氟戊基、2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5-八氟戊基、4, 4, 4-三氟-3-甲基丁基以及 2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5, 5-九氟戊基；C6 氟烷基如 2-氟己基、2, 2-二氟己基、3-氟己基、3, 3-二氟己基、4-氟己基、4, 4-二氟己基、5-氟己基、5, 5-二氟己基、6-氟己基、6, 6-二氟己基、6, 6, 6-三氟己基、5, 5, 6, 6, 6-五氟己基、4, 4, 5, 5, 6, 6, 6-七氟己基、3, 3, 4, 4, 5, 5, 6, 6, 6-九氟己基、3-(三氟甲基)戊基以及 2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5, 6, 6, 6-十一氟己基；C7 氟烷基如 3-(三氟甲基)己基和 4-甲基-3-(三氟甲基)戊基；以及 C8 氟烷基如 4, 4-二甲基-3-(三氟甲基)戊基。

群組 E 係由 $-OR^8$ 、 $-SR^8$ 、 $-SO-R^8$ 、 $-SO_2-R^8$ 、氟基、羥基、氯原子以及溴原子所組成。

“ $-OR^8$ ” 所示之基團之實例包含視需要經鹵化之 C1-C4 烷氧基如 2-丙炔基氧基和 2-丁炔基氧基；視需要經鹵化之 C2-C4 烯氧基；視需要經鹵化之 C2-C4 炔氧基；以及視需要經鹵化之 C3-C6 環烷氧基。

“ $-SR^8$ ” 所示之基團之實例包含視需要經鹵化之 C1-C4 烷硫基。

“ $-SO-R^8$ ”所示之基團之實例包含視需要經鹵化之 C1-C4 烷基亞磺基。

“ $-SO_2-R^8$ ”所示之基團之實例包含視需要經鹵化之 C1-C4 烷基磺基。

本文所使用之“視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基”之實例包含視需要經鹵化之 C1-C4 烷基、視需要經鹵化之 C2-C4 烯基以及視需要經鹵化之 C2-C4 炔基。

本文所使用之“視需要經鹵化之 C1-C4 烷基”之實例包含 C1-C4 烷基如甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基(後文中，可稱為異丙基)、2,2-二甲基丙基以及 1,1-二甲基乙基(後文中，可稱為第三丁基)；以及 C1-C4 鹵烷基如氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、2,2,2-三氟乙基、1,1,2,2-四氟乙基以及 1,1,2,2,2-五氟乙基。

本文所使用之“視需要經鹵化之 C2-C4 烯基”之實例包含 C1-C4 烯基如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-丁烯基以及 2-丁烯基；以及 C1-C4 鹵烯基如 2,2-二氟乙烯基、1,2,2-三氟乙烯基以及 3,3-二氟-2-丙烯基。

本文所使用之“視需要經鹵化之 C2-C4 炔基”之實例包含 C1-C4 炔基如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-甲基-2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基以及 3-丁炔基；以及 C1-C4 鹵炔基如 3,3,3-三氟-1-丙炔基。

本文所使用之“視需要經鹵化之苯基”之實例包含苯基；以及經鹵化之苯基如 4-氯苯基、2-氟苯基以及 4-氟苯

基。

本文所使用之“視需要經鹵化之 C1-C4 烷氧基”之實例包含 C1-C4 烷氧基如甲氧基、乙氧基以及丙氧基；以及 C1-C4 鹵烷氧基如三氟甲氧基、溴二氟甲氧基、二氟甲氧基、氯二氟甲氧基、五氟乙氧基、2, 2, 2-三氟乙氧基以及 1, 1, 2, 2-四氟乙氧基。

本文所使用之“視需要經鹵化之 C3-C6 烯氧基”之實例包含 C3-C6 烯氧基如 1-丙烯基氧基、2-丙烯基氧基、1-甲基-2-丙烯基氧基以及 1, 1-二甲基-2-丙烯基氧基；以及 C3-C6 鹵烯氧基如 2, 2-二氟-2-丙烯基氧基。

本文所使用之“視需要經鹵化之 C3-C6 炔氧基”之實例包含 C3-C6 炔氧基如 2-丙炔基氧基、1-甲基-2-丙炔基氧基、1, 1-二甲基-2-丙炔基氧基、2-丁炔基氧基、1-甲基-2-丁炔基氧基以及 1, 1-二甲基-2-丁炔基氧基；以及 C3-C6 鹵炔氧基如 3, 3, 3-三氟-1-丙炔基氧基。

本文所使用之“視需要經鹵化之 C1-C4 烷基胺基”之實例包含 C1-C4 烷基胺基如 N-甲基胺基、N-乙基胺基、N-丙基胺基以及 N-(1-甲基乙基)胺基；以及(C1-C4 鹵烷基)胺基如 N-(2, 2, 2-三氟乙基)胺基。

本文所使用之“視需要經鹵化之二(C1-C4 烷基)胺基”之實例包含二(C1-C4 烷基)胺基如 N, N-二甲基胺基、N-乙基-N-甲基胺基、N, N-二乙基胺基、N-甲基-N-丙基胺基、N-乙基-N-丙基胺基、N, N-二丙基胺基、N-甲基-N-(1-甲基乙基)胺基、N-乙基-N-(1-甲基乙基)胺基以及 N, N-二

(1-甲基乙基)胺基；以及二(C1-C4 鹵烷基)胺基如 N-甲基-N-(2, 2, 2-三氟乙基)胺基和 N-甲基-N-乙基-N-(2, 2, 2-三氟乙基)胺基。

本文所使用之“C2-C5 環胺基”之實例包含 1-氮雜環丙基、1-氮雜環丁基、1-吡咯啉基、N-六氮吡啶基以及 N-嗎啉基。

本發明化合物之實例包含下列者：

式(I)之化合物，式中，m 為 1；

式(I)之化合物，式中，m 為 2；

式(I)之化合物，式中，m 為 1，且 R^3 和 R^4 為氫原子；

式(I)之化合物，式中，m 為 2，且 R^3 和 R^4 為氫原子；

式(I)之化合物，式中， R^1 為鹵素原子或氫原子；

式(1)之化合物，式中， R^2 為 $-C(=G^1)R^6$ (式中， G^1 和 R^6 係如上文所定義)或氰基；

式(1)之化合物，式中， R^2 為氰基；

式(1)之化合物，式中， R^1 為鹵素原子或氫原子，且 R^2 為 $-C(=G^1)R^6$ (式中， G^1 和 R^6 係如上文所定義)或氰基；

式(1)之化合物，式中， R^1 為鹵素原子或氫原子，且 R^2 為 $-C(=G^1)R^6$ (式中， G^1 和 R^6 係如上文所定義)；

式(1)之化合物，式中， R^1 為鹵素原子或氫原子，且 R^2 為氰基；

式(1)之化合物，式中， R^1 為視需要經取代之 C1-C4 鏈烴基，且 R^2 為 $-C(=G^1)R^6$ (式中， G^1 和 R^6 係如上文所定義)或氰基；

式(1)之化合物，式中， R^1 為視需要經取代之 C1-C4 鏈烴基，

且 R^2 為氰基；

式(1)之化合物，式中， R^1 為甲基，且 R^2 為 $-C(=G^1)R^6$ (式中， G^1 和 R^6 係如上文所定義)或氰基；

式(1)之化合物，式中， R^1 為甲基，且 R^2 為氰基；

式(1)之化合物，式中， R^1 為氯原子，且 R^2 為 $-C(=G^1)R^6$ (式中， G^1 和 R^6 係如上文所定義)或氰基；

式(1)之化合物，式中， R^1 為氯原子，且 R^2 為氰基；

式(1)之化合物，式中， R^1 為視需要經取代之 C1-C4 鏈烴基，且 R^2 為 $-C(=G^1)R^6$ (式中， G^1 和 R^6 係如上文所定義)或氰基；

式(1)之化合物，式中， R^5 為視需要經取代之 C1-C4 鏈烴基；

式(1)之化合物，式中，X 為氧原子，且 R^5 為視需要經取代之 C1-C4 鏈烴基；

式(1)之化合物，式中，X 為硫原子，且 R^5 為視需要經取代之 C1-C4 鏈烴基；

式(1)之化合物，式中，A 為 C2-C5 氟烷基， R^1 為氫原子或 C1-C4 烷基， R^2 為氰基， R^3 和 R^4 獨立表示氫原子或 C1-C4 烷基， R^5 為氫原子或 C1-C4 烷基，以及 X 為氧原子或硫原子；以及

式(1)之化合物，式中，A 為 C2-C5 氟烷基， R^1 為氫原子， R^2 為氰基， R^3 和 R^4 獨立表示氫原子或 C1-C4 烷基， R^5 為氫原子或 C1-C4 烷基，以及 X 為氧原子或硫原子。

【實施方式】

接著，說明用於製造本發明化合物之製程。

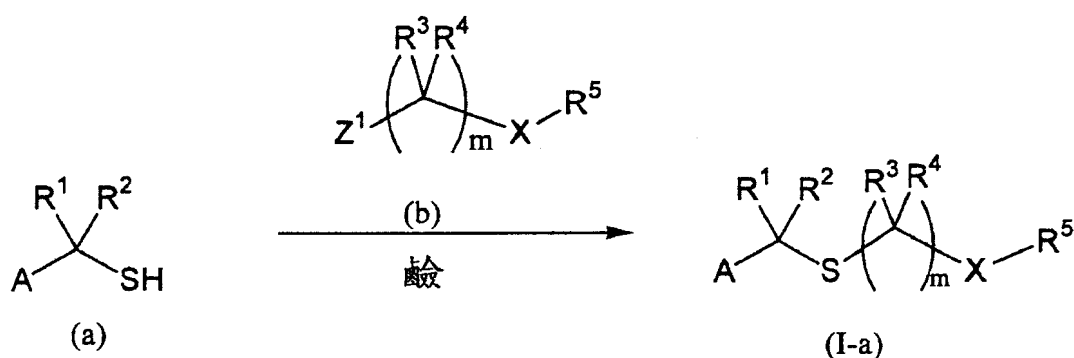
於本發明之化合物中，式(I-a)所示之化合物(式中，n

為 0) 可藉由例如下列製法 1 至製法 5 製造。

後文中，式 (α) (α = 任意符號) 所示之化合物可稱為「化合物 (α)」。

製法 1

式 (I-a) 所示之化合物可藉由例如在鹼之存在下，使化合物 (a) 與化合物 (b) 反應而製造：



式中，A、X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵ 以及 m 係如上文所定義，且 Z¹ 表示如氯原子、溴原子、碘原子、甲磺醯基或對甲苯磺醯基等脫離基(leaving group)。

該反應通常於溶劑之存在下進行。

溶劑之實例包含醚類諸如乙醚、四氫呋喃以及二甲氧基乙烷；醯胺類諸如 N,N-二甲基甲醯胺；有機硫類諸如二甲亞碲和環丁碲；脂族烴類諸如己烷和庚烷；芳香族烴類諸如甲苯和二甲苯；鹵化烴類諸如 1,2-二氯乙烷和氯苯；水；以及其混合物。

鹼之實例包含無機鹼類諸如氫化鈉、氫氧化鈉、氫氧化鉀以及碳酸鉀；鹼金屬烷醇鹽諸如甲醇鈉和第三丁醇鉀；以及有機鹼類諸如三乙胺、1,4-二氮雜雙環[2.2.2]辛烷以及 1,8-二氮雜雙環[5.4.0]-7-十一烯。

鹼之用量相對於每 1 莫耳化合物(a)，通常係 1 至 10 莫耳。

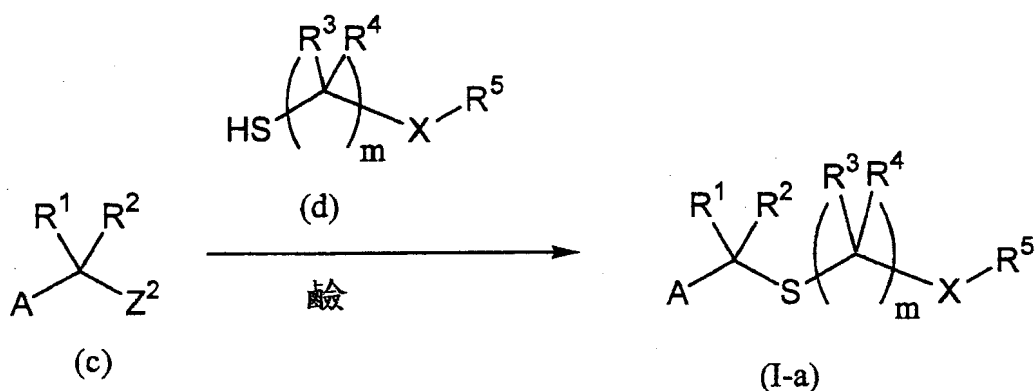
化合物(b)之量相對於每 1 莫耳化合物(a)，通常係 1 至 10 莫耳。

反應溫度通常在 -50 至 100°C 之範圍內，且反應時間通常在 1 至 24 小時之範圍內。

反應完成後，可藉由例如將反應混合物倒入水中並以有機溶劑萃取該混合物，接著再進行濃縮，而將化合物(I-a)單離。經單離之化合物(I-a)可藉由層析法、再結晶等進一步純化。

製法 2

式(I-a)所示之化合物亦可藉由在鹼之存在下，使化合物(c)與化合物(d)反應而製造：



式中，A、X、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 以及 m 係如上文所定義，且 Z^2 表示如氯原子、溴原子、碘原子、甲磺醯基或對甲苯磺醯基等脫離基。

該反應通常於溶劑之存在下進行。

溶劑之實例包含醚類諸如二乙醚、四氫呋喃以及二甲氧基乙烷；醯胺類諸如 N,N-二甲基甲醯胺；有機硫類諸如

二甲亞碲和環丁碲；脂族烴類諸如己烷和庚烷；芳香族烴類諸如甲苯和二甲苯；鹵化烴類諸如 1,2-二氯乙烷和氯苯；水；以及其混合物。

鹼之實例包含無機鹼類諸如氫化鈉、氫氧化鈉、氫氧化鉀以及碳酸鉀；鹼金屬烷醇鹽諸如甲醇鈉以及第三丁醇鉀；以及有機鹼類諸如二乙胺、1,4-二氮雜雙環[2.2.2]辛烷以及 1,8-二氮雜雙環[5.4.0]-7-十一烯。

鹼之用量相對於每 1 莫耳化合物(d)，通常係 1 至 10 莫耳。

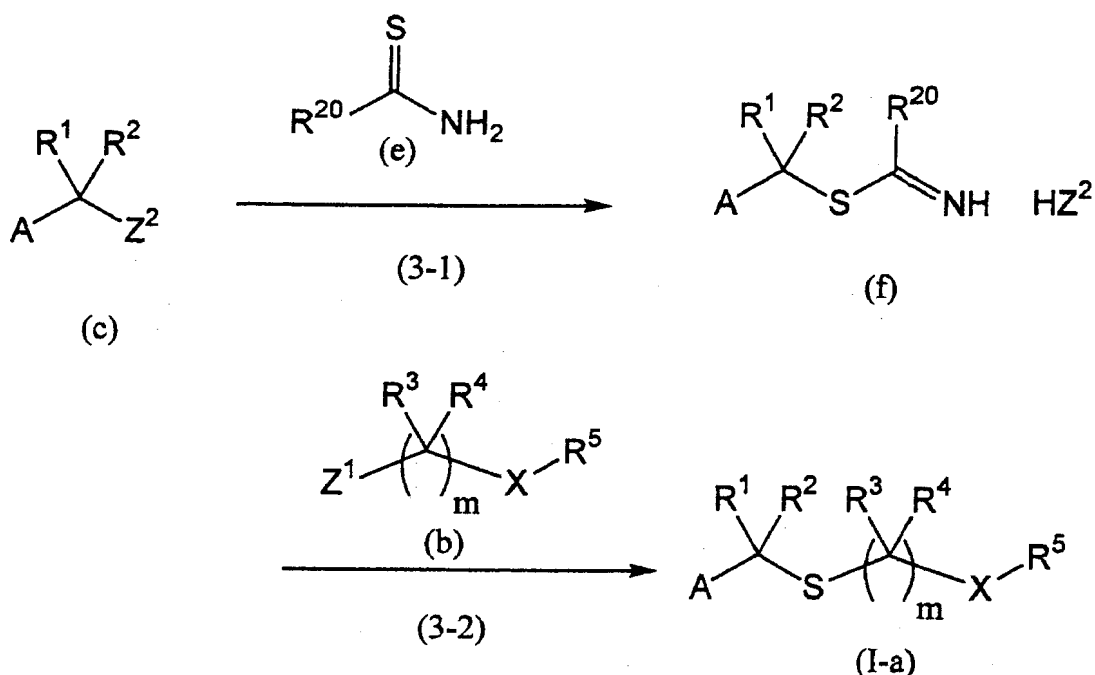
化合物(c)之量相對於每 1 莫耳化合物(d)，通常係 1 至 10 莫耳。

反應溫度通常在-50 至 100°C 之範圍內，且反應時間通常在 1 至 24 小時之範圍內。

反應完成後，可藉由例如將反應混合物倒入水中並以有機溶劑萃取該混合物，接著再進行濃縮，而將化合物(I-a)單離。經單離之化合物(I-a)可藉由層析法、再結晶等進一步純化。

製法 3

式(I-a)所示之化合物亦可藉由下述方法從化合物(c)製造：



式中，A、X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、m、Z¹以及Z²係如上文所定義，且R²⁰表示甲基或胺基。

步驟(3-1)

化合物(f)可藉由使化合物(c)與化合物(e)反應而製造。

該反應通常於溶劑之存在下進行。

溶劑之實例包含鹵化烴類諸如二氯甲烷和氯仿；醇類諸如甲醇和乙醇；以及其混合物。

化合物(e)之量相對於每 1 莫耳化合物(c)，通常係 1 至 3 莫耳。

反應溫度通常在 20 至 200°C 之範圍內，且反應時間通常在 0.5 至 240 小時之範圍內。

反應完成後，可藉由例如將反應混合物濃縮而將化合物(f)單離。經單離之化合物(f)無須純化即可用於步驟(3-2)中，或若有需要，可藉由再結晶等進行進一步純化後

用於步驟(3-2)中。

步驟(3-2)

式(I-a)所示之化合物可藉由在鹼之存在下，使化合物(f)與化合物(b)反應而製造。

該反應通常於溶劑之存在下進行。

溶劑之實例包含醚類諸如乙醚、四氫呋喃以及二甲氧基乙烷；鹼胺類諸如 N,N-二甲基甲醯胺；有機硫類諸如二甲亞砷和環丁砷；脂族烴類諸如己烷和庚烷；芳香族烴類諸如甲苯和二甲苯；鹵化烴類諸如 1,2-二氯乙烷和氯苯；水；以及其混合物。

鹼之實例包含無機鹼類諸如氫氧化鈉和氫氧化鉀；以及鹼金屬烷醇鹽諸如甲醇鈉和第三丁醇鉀。

鹼之用量相對於每 1 莫耳化合物(f)，通常係 1 至 50 莫耳。

化合物(b)之量相對於每 1 莫耳化合物(f)，通常係 1 至 10 莫耳。

若有需要，可使用相轉移觸媒如溴化四正丁基銨進行反應。相轉移觸媒之量相對於每 1 莫耳化合物(f)，通常係 0.05 至 1.0 莫耳。

反應溫度通常在 -50 至 100°C 之範圍內，且反應時間通常在 1 至 24 小時之範圍內。

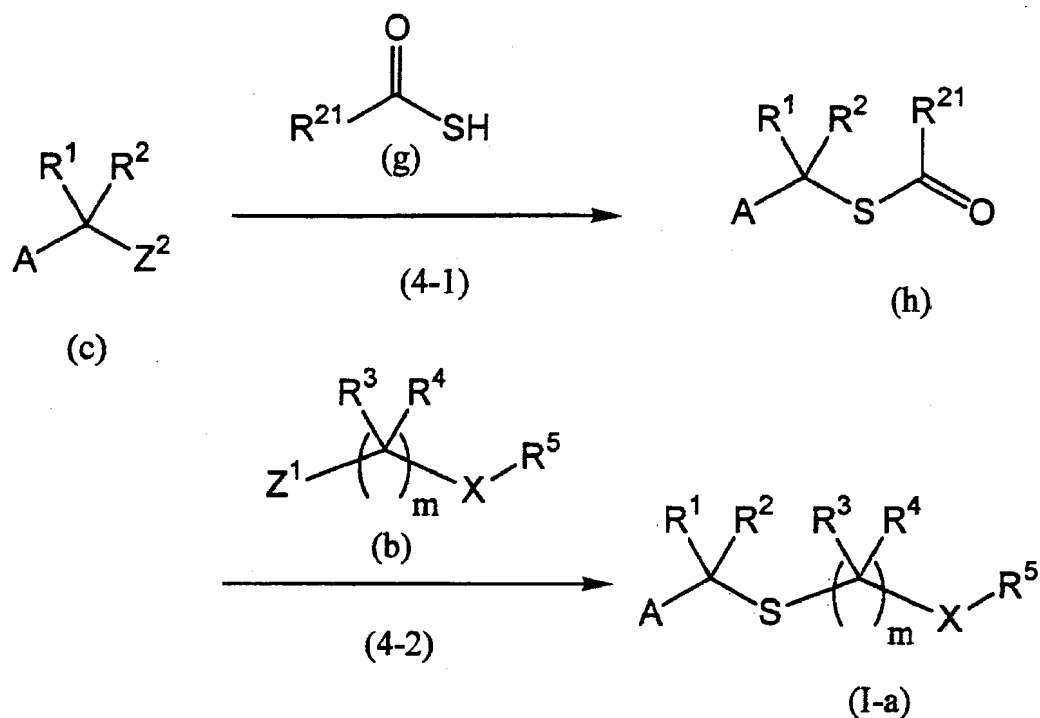
反應完成後，可藉由例如將反應混合物倒入水中並以有機溶劑萃取該混合物，接著再進行濃縮，而將化合物(I-a)單離。經單離之化合物(I-a)可藉由層析法、再結晶等進一

步純化。

製法 4

式(I-a)所示之化合物亦可藉由下述方法從化合物(c)

製造：



式中，A、X、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、m、 Z^1 以及 Z^2 係如上文所定義，且 R^{21} 表示甲基或苯基。

步驟(4-1)

化合物(h)可藉由在鹼之存在下，使化合物(c)與化合物(g)反應而製造。

該反應通常於溶劑之存在下進行。

溶劑之實例包含醚類諸如乙醚、四氫呋喃以及二甲氧基乙烷；鹽胺類諸如N,N-二甲基甲鹽胺；有機硫類諸如二甲亞碲和環丁碲；脂族烴類諸如己烷和庚烷；芳香族烴類諸如甲苯和二甲苯；鹵化烴類諸如1,2-二氯乙烷和氯苯；

水；以及其混合物。

鹼之實例包含無機鹼類諸如氫化鈉和碳酸鉀；以及有機鹼類諸如三乙胺、1,4-二氮雜雙環[2.2.2]辛烷和 1,8-二氮雜雙環[5.4.0]-7-十一烯。

鹼之用量相對於每 1 莫耳化合物(c)，通常係 1 至 10 莫耳。

化合物(g)之量相對於每 1 莫耳化合物(c)，通常係 1 至 5 莫耳。

反應溫度通常在-20 至 80°C 之範圍內，而且反應時間通常在 1 至 24 小時之範圍內。

反應完成後，可藉由例如將反應混合物倒入酸性水(如稀鹽酸)中並以有機溶劑萃取該混合物，接著再進行濃縮，而將化合物(h)單離。經單離之化合物(h)可藉由層析法、再結晶等進一步純化。

步驟(4-2)

式(I-a)所示之化合物可藉由在鹼之存在下，使化合物(b)與化合物(h)反應而製造。

該反應通常於溶劑之存在下進行。

溶劑之實例包含醚類諸如乙醚、四氫呋喃以及二甲氧基乙烷；鹽胺類諸如 N,N-二甲基甲鹽胺；有機硫類諸如二甲亞碲和環丁碲；脂族烴類諸如己烷和庚烷；芳香族烴類諸如甲苯和二甲苯；鹵化烴類諸如 1,2-二氯乙烷和氯苯；水；以及其混合物。

鹼之實例包含無機鹼類諸如氫氧化鈉和氫氧化鉀；以

及鹼金屬烷醇鹽諸如甲醇鈉、乙醇鈉以及第三丁醇鉀。

鹼之用量相對於每 1 莫耳化合物(h)，通常係 1 至 10 莫耳。

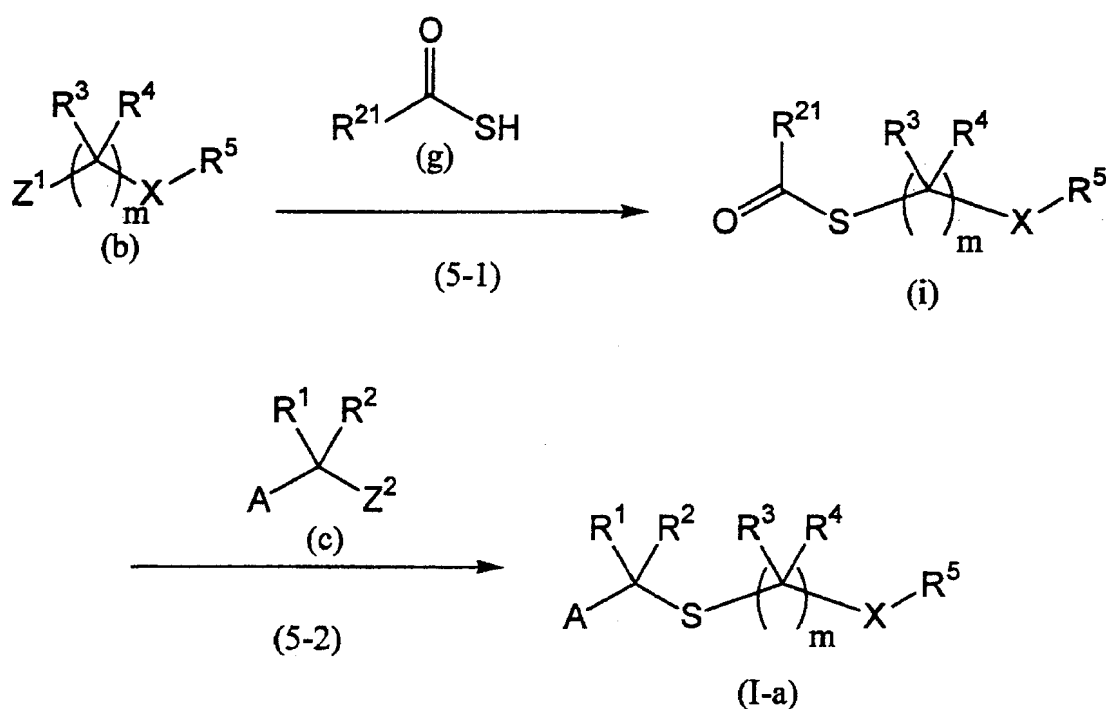
化合物(b)之量相對於每 1 莫耳化合物(h)，通常係 1 至 10 莫耳。

反應溫度通常在 -50 至 100°C 之範圍內，而且反應時間通常在 1 至 24 小時之範圍內。

反應完成後，可藉由例如將反應混合物倒入水中並以有機溶劑萃取該混合物，接著再進行濃縮，而將化合物(I-a)單離。經單離之化合物(I-a)可藉由層析法、再結晶等進一步純化。

製法 5

式(I-a)所示之化合物亦可藉由下述方法從化合物(b)製造：



式中，A、X、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^{21} 、m、 Z^1 以及 Z^2 係如上

文所定義。

步驟(5-1)

化合物(i)可藉由在鹼之存在下，使化合物(b)與化合物(g)反應而製造。

該反應通常於溶劑之存在下進行。

溶劑之實例包含醚類諸如乙醚、四氫呋喃以及二甲氧基乙烷；鹼胺類諸如 N,N-二甲基甲鹼胺；有機硫類諸如二甲亞碲和環丁碲；脂族烴類諸如己烷和庚烷；芳香族烴類諸如甲苯和二甲苯；鹵化烴類諸如 1,2-二氯乙烷和氯苯；水；以及其混合物。

鹼之實例包含無機鹼類諸如氫化鈉和碳酸鉀；以及有機鹼類諸如三乙胺、1,4-二氮雜雙環[2.2.2]辛烷和 1,8-二氮雜雙環[5.4.0]-7-十一烯。

鹼之用量相對於每 1 莫耳化合物(b)，通常係 1 至 10 莫耳。

化合物(g)之量相對於每 1 莫耳化合物(b)，通常係 1 至 5 莫耳。

反應溫度通常在 -20 至 80°C 之範圍內，且反應時間通常在 1 至 24 小時之範圍內。

反應完成後，可藉由例如將反應混合物倒入酸性水(如稀鹽酸)中並以有機溶劑萃取該混合物，接著再進行濃縮，而將化合物(i)單離。經單離之化合物(i)可藉由層析法、再結晶等進一步純化。

步驟(5-2)

式(I-a)所示之化合物可藉由在鹼之存在下，使化合物(c)與化合物(i)反應而製造。

該反應通常於溶劑之存在下進行。

溶劑之實例包含醚類諸如乙醚、四氫呋喃以及二甲氧基乙烷；鹼胺類諸如 N,N-二甲基甲鹼胺；有機硫類諸如二甲亞碲和環丁碲；脂族烴類諸如己烷和庚烷；芳香族烴類諸如甲苯和二甲苯；鹵化烴類諸如 1,2-二氯乙烷和氯苯；水；以及其混合物。

鹼之實例包含無機鹼類諸如氫氧化鈉和氫氧化鉀；以及鹼金屬烷醇鹽諸如甲醇鈉、乙醇鈉以及第三丁醇鉀。

鹼之用量相對於每 1 莫耳化合物(i)，通常係 1 至 10 莫耳。

化合物(c)之量相對於每 1 莫耳化合物(i)，通常係 1 至 10 莫耳。

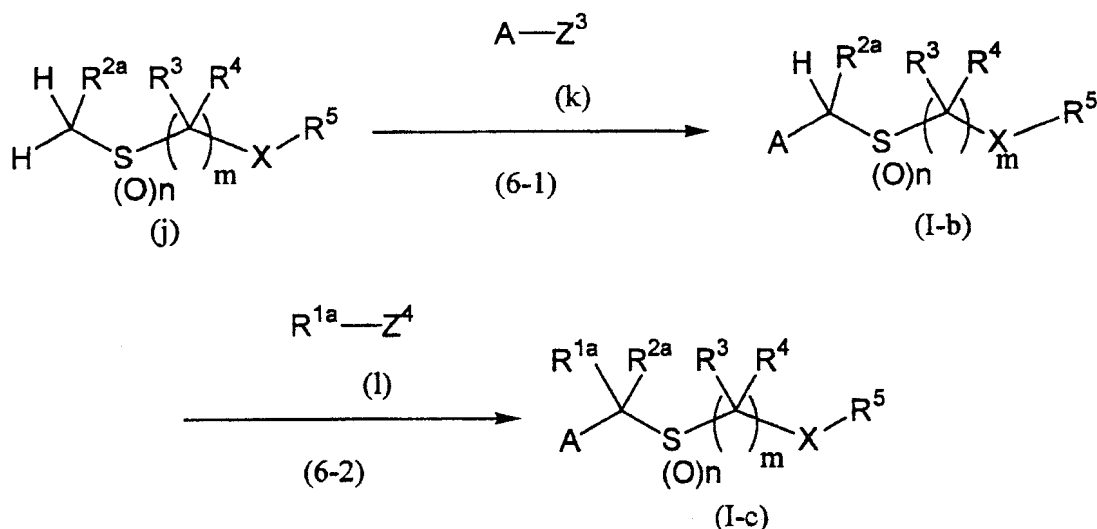
反應溫度通常在 -50 至 100°C 之範圍內，而且反應時間通常在 1 至 24 小時之範圍內。

反應完成後，可藉由例如將反應混合物倒入水中並以有機溶劑萃取該混合物，接著再進行濃縮，而將化合物(I-a)單離。經單離之化合物(I-a)可藉由層析法、再結晶等進一步純化。

製法 6

於式(I)所示之本發明化合物中，化合物(I-b)(式中， R^1 為氫原子，且 R^2 為 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^6$ 或氰基)可藉由下文所示之步驟(6-1)製造，以及化合物(I-c)(式中， R^1 為視需要經鹵化

之 C1-C4 鏈烴基，且 R^2 為 $-C(=O)R^6$ 或氰基)可藉由下文所示之步驟(6-2)製造：



式中， A 、 X 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 n 以及 m 係如上文所定義， Z^3 和 Z^4 表示如氯原子、溴原子、碘原子、甲磺醯基或對甲苯磺醯基之脫離基， R^{1a} 表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基，以及 R^{2a} 表示 $-C(=O)R^6$ 或氰基。

步驟(6-1)

式(I-b)所示之化合物可藉由在鹼之存在下，使化合物(k)與化合物(j)反應而製造。

該反應通常於溶劑之存在下進行。

溶劑之實例包含醚類諸如乙醚、四氫呋喃以及二甲氧基乙烷；醯胺類諸如 N,N-二甲基甲醯胺；有機硫類諸如二甲亞砷和環丁砷；脂族烴類諸如己烷和庚烷；芳香族烴類諸如甲苯和二甲苯；鹵化烴類諸如 1,2-二氯乙烷和氯苯；水；以及其混合物。

鹼之實例包含無機鹼類諸如氫化鈉、氫氧化鈉、氫氧化鉀以及碳酸鉀；鹼金屬烷醇鹽諸如甲醇鈉以及第三丁醇

鉀；以及有機鹼類諸如三乙胺、1,4-二氮雜雙環[2.2.2]辛烷以及1,8-二氮雜雙環[5.4.0]-7-十一烯。

鹼之用量相對於每1莫耳化合物(j)，通常係1至10莫耳。

化合物(k)之量相對於每1莫耳化合物(j)，通常係1至10莫耳。

反應溫度通常在-50至100°C之範圍內，且反應時間通常在1至24小時之範圍內。

反應完成後，可藉由例如將反應混合物倒入水中並以有機溶劑萃取該混合物，接著再進行濃縮，而將化合物(I-b)單離。經單離之化合物(I-b)可藉由層析法、再結晶等進一步純化。

步驟(6-2)

式(I-c)所示之化合物可藉由在鹼之存在下，使化合物(1)與化合物(I-b)反應而製造。

該反應通常於溶劑之存在下進行。

溶劑之實例包含醚類諸如乙醚、四氫呋喃以及二甲氧基乙烷；醯胺類諸如N,N-二甲基甲醯胺；有機硫類諸如二甲亞碲和環丁碲；脂族烴類諸如己烷和庚烷；芳香族烴類諸如甲苯和二甲苯；鹵化烴類諸如1,2-二氯乙烷和氯苯；水；以及其混合物。

鹼之實例包含無機鹼類諸如氫化鈉、氫氧化鈉、氫氧化鉀以及碳酸鉀；鹼金屬烷醇鹽諸如甲醇鈉和第三丁醇鉀；以及有機鹼類諸如三乙胺、1,4-二氮雜雙環[2.2.2]

辛烷以及 1,8-二氮雜雙環[5.4.0]-7-十一烯。

鹼之用量相對於每 1 莫耳化合物(I-b)，通常係 1 至 10 莫耳。

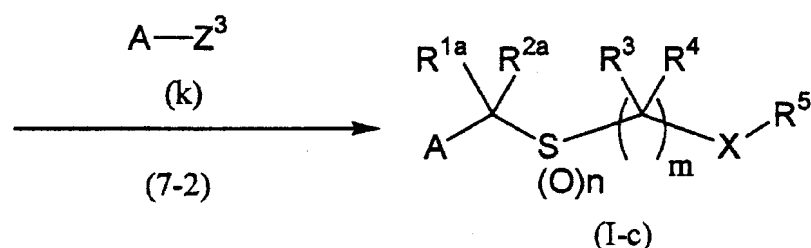
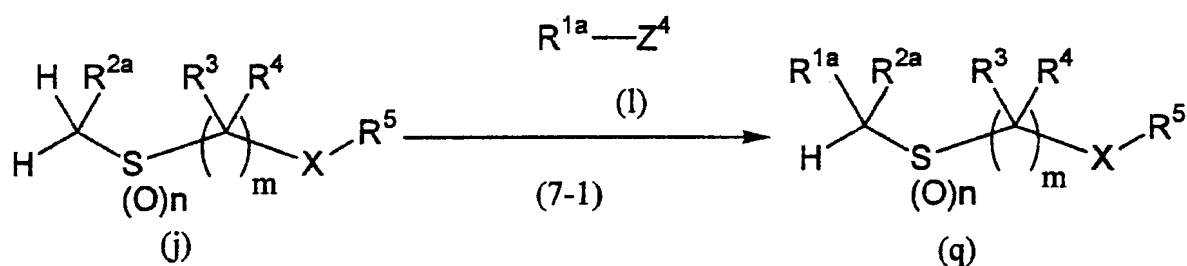
化合物(1)之量相對於每 1 莫耳化合物(I-b)，通常係 1 至 10 莫耳。

反應溫度通常在 -50 至 100°C 之範圍內，而且反應時間通常在 1 至 24 小時之範圍內。

反應完成後，可藉由例如將反應混合物倒入水中並以有機溶劑萃取該混合物，接著再進行濃縮，而將化合物(I-c)單離。經單離之化合物(I-c)可藉由層析法、再結晶等進一步純化。

製法 7

於式(I)所示之本發明化合物中，化合物(I-c)(式中， R^1 為視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基，且 R^2 為 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^6$ 或氰基)亦可藉由下述方法從化合物(j)製造：



式中，A、X、 R^{1a} 、 R^{2a} 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、n、m、 Z^3 以及 Z^4 係如上文所定義。

步驟(7-1)

化合物(q)可藉由在鹼之存在下，使化合物(1)與化合物(j)反應而製造。

該反應通常於溶劑之存在下進行。

溶劑之實例包含醚類諸如乙醚、四氫呋喃以及二甲氧基乙烷；鹽胺類諸如 N,N-二甲基甲鹽胺；有機硫類諸如二甲亞碲和環丁碲；脂族烴類諸如己烷和庚烷；芳香族烴類諸如甲苯和二甲苯；鹵化烴類諸如 1,2-二氯乙烷和氯苯；水；以及其混合物。

鹼之實例包含無機鹼類諸如氫化鈉、氫氧化鈉、氫氧化鉀以及碳酸鉀；鹼金屬烷醇鹽諸如甲醇鈉和第三丁醇鉀；以及有機鹼類諸如三乙胺、1,4-二氮雜雙環[2.2.2]辛烷以及 1,8-二氮雜雙環[5.4.0]-7-十一烯。

鹼之用量相對於每 1 莫耳化合物(j)，通常係 1 至 10 莫耳。

化合物(1)之量相對於每 1 莫耳化合物(j)，通常係 1 至 10 莫耳。

反應溫度通常在 -50 至 100°C 之範圍內，且反應時間通常在 1 至 24 小時之範圍內。

反應完成後，可藉由例如將反應混合物倒入水中並以有機溶劑萃取該混合物，接著再進行濃縮，而將化合物(q)單離。若有需要，經單離之化合物(q)可藉由層析法、再結

晶等進一步純化。

步驟(7-2)

式(I-c)所示之化合物可藉由在鹼之存在下，使化合物(k)與化合物(q)反應而製造。

該反應通常於溶劑之存在下進行。

溶劑之實例包含醚類諸如乙醚、四氫呋喃以及二甲氧基乙烷；鹼胺類諸如 N,N-二甲基甲醯胺；有機硫類諸如二甲亞碲和環丁碲；脂族烴類諸如己烷和庚烷；芳香族烴類諸如甲苯和二甲苯；鹵化烴類諸如 1,2-二氯乙烷和氯苯；水；以及其混合物。

鹼之實例包含無機鹼類諸如氫化鈉、氫氧化鈉、氫氧化鉀以及碳酸鉀；鹼金屬烷醇鹽諸如甲醇鈉和第三丁醇鉀；以及有機鹼類諸如三乙胺、1,4-二氮雜雙環[2.2.2]辛烷以及 1,8-二氮雜雙環[5.4.0]-7-十一烯。

鹼之用量相對於每 1 莫耳化合物(q)，通常係 1 至 10 莫耳。

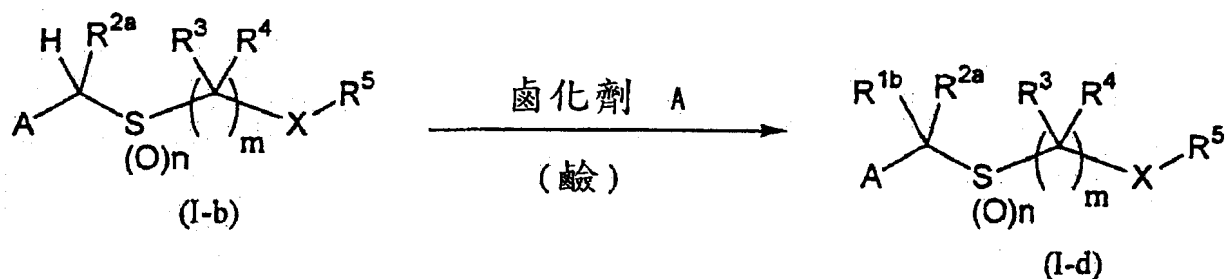
化合物(k)之量相對於每 1 莫耳化合物(q)，通常係 1 至 10 莫耳。

反應溫度通常在 -50 至 100°C 之範圍內，且反應時間通常在 1 至 24 小時之範圍內。

反應完成後，可藉由例如將反應混合物倒入水中並以有機溶劑萃取該混合物，接著再進行濃縮，而將化合物(I-c)單離。若有需要，經單離之化合物(I-c)可藉由層析法、再結晶等進一步純化。

參考製法 1

於式(I)所示之本發明化合物中，化合物(式中， R^1 為鹵素原子，且 R^2 為 $-C(=O)R^6$ 或氰基)可藉由下述方法從化合物(I-b)製造：



式中，A、X、 R^{2a} 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、n 以及 m 係如上文所定義，且 R^{1b} 表示鹵素原子。

該反應通常於溶劑之存在下進行。

溶劑之實例包含醯胺類諸如 N,N-二甲基甲醯胺；醚類諸如乙醚和四氫呋喃；有機硫類諸如二甲亞砷和環丁砷；鹵化烴類諸如氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷、二氯甲烷以及二氯苯；脂族腈類諸如乙腈和丙腈；芳香族烴類諸如甲苯和二甲苯；水；以及其混合物。

該反應可於鹼之存在下進行。

鹼之實例包含無機鹼類諸如氫化鈉、氫氧化鈉、氫氧化鉀以及碳酸鉀；鹼金屬烷醇鹽諸如甲醇鈉和第三丁醇鉀；鹼金屬胺化物類(alkali metal amides)諸如二異丙基胺化鋰；以及有機鹼類諸如三乙胺、1,4-二氮雜雙環[2.2.2]辛烷以及 1,8-二氮雜雙環[5.4.0]-7-十一烯。

鹼之用量相對於每 1 莫耳化合物(I-b)，通常係 1 至 10 莫耳。

鹵化劑 A 之實例包含鹵化烴類諸如四氯化碳和六氯乙烷；鹵素諸如氟、氯、溴以及碘；N-鹵化琥珀醯亞胺類諸如 N-氯琥珀醯亞胺、N-溴琥珀醯亞胺以及 N-碘琥珀醯亞胺；N-氟吡啶鎗鹽類諸如 1-氟-2,4,6-三甲基吡啶鎗三氟甲磺酸鹽以及 1,1'-二氟-2,2'-聯吡啶鎗雙四氟硼酸鹽；以及無機鹽類諸如氯化銅(II)和溴化銅(II)。

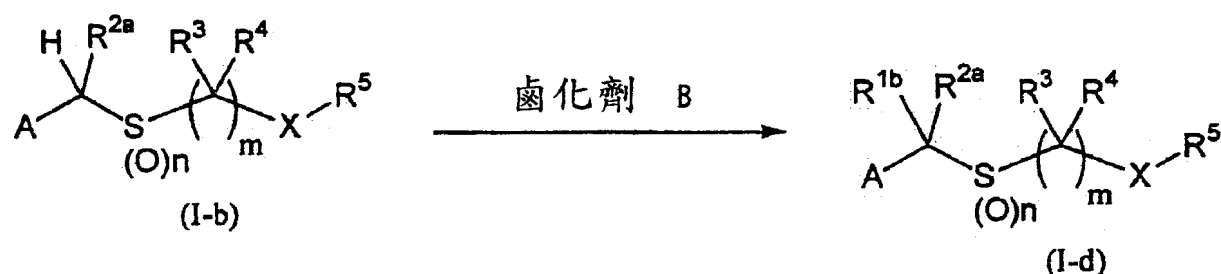
鹵化劑 A 之量相對於每 1 莫耳化合物(I-b)，通常係 1 至 10 莫耳。

反應溫度通常在 -100 至 100°C 之範圍內，且反應時間通常在 1 至 24 小時之範圍內。

反應完成後，可藉由例如將反應混合物倒入水中並以有機溶劑萃取該混合物，接著再進行濃縮，而將化合物(I-d)單離。若有需要，經單離之化合物(I-d)可藉由層析法、再結晶等進一步純化。

參考製法 2

於式(I)所示之本發明化合物中，化合物(式中， R^1 為鹵素原子，且 R^2 為 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^5$ 或氰基)可藉由下述方法從化合物(I-b)製造：



式中，A、X、 R^{1b} 、 R^{2a} 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、n 以及 m 係如上文所定義。

該反應通常於溶劑之存在下進行。

溶劑之實例包含鹵化烴類諸如氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷、二氯甲烷以及二氯苯；脂族腈類諸如乙腈和丙腈；芳香族烴類諸如甲苯和二甲苯；脂族羧酸類諸如乙酸；二硫化碳；水；以及其混合物。

鹵化劑 B 之實例包含鹵素諸如氟、氯、溴以及碘；鹵化氫類諸如氟化氫、氯化氫、溴化氫以及碘化氫；鹵化硫化合物類諸如亞硫醯氯、亞硫醯溴以及硫醯氯；以及鹵化磷化合物類諸如三氯化磷、三溴化磷、五氯化磷以及磷醯氯。

鹵化劑 B 之量相對於每 1 莫耳化合物(I-b)，通常係 1 至 10 莫耳。

反應溫度通常在 -100 至 200°C 之範圍內，且反應時間通常在 1 至 24 小時之範圍內。

反應完成後，可藉由例如將反應混合物倒入水中並以有機溶劑萃取該混合物，接著再進行濃縮，而將化合物(I-d)單離。若有需要，經單離之化合物(I-d)可藉由層析法、再結晶等進一步純化。

參考製法 3

於式(I)所示之本發明化合物中，式(I-e)所示之化合物(式中， n 為 1 或 2)可藉由使用氧化劑將式(I-a)所示之化合物氧化而製造：



式中，A、X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵以及 m 係如上文所定義，且 n' 表示 1 或 2。

該反應通常於溶劑之存在下進行。

溶劑之實例包含醇類諸如甲醇和乙醇；鹵化烴類諸如二氯甲烷和氯仿；脂族烴類諸如甲苯和二甲苯；脂族羧酸類諸如乙酸和三氟乙酸；水；以及其混合物。

氧化劑之實例包含有機過氧化物類諸如過氧乙酸、三氟過氧乙酸以及間氯過氧苯甲酸類；鹵素例如氯和溴；含鹵素之醯亞胺類諸如 N-氯琥珀醯亞胺；鹵化物類諸如過氯酸(或其鹽)和過碘酸(或其鹽)；過錳酸鹽類諸如過錳酸鉀；鉻酸鹽類諸如鉻酸鉀；過硫酸鹽類諸如過硫酸鉀；以及過氧化氫。

氧化劑於反應中之用量相對於每 1 莫耳化合物 (I-a)，通常為 1 至 10 莫耳。

反應溫度通常在 -50 至 200°C 之範圍內，且反應時間通常在 1 至 72 小時之範圍內。

反應完成後，可藉由例如將反應混合物倒入水中並以有機溶劑萃取該混合物，接著再進行濃縮，而將化合物 (I-e) 單離。若有需要，經單離之化合物 (I-e) 可藉由層析法、再結晶等進一步純化。

化合物(a)、化合物(b)、化合物(c)、化合物(d)、化合物(e)以及化合物(g)可根據已知製造法製造。

本發明化合物對節肢動物害蟲顯現防治效果，該節肢動物害蟲之實例包含有害昆蟲及有害蟲蟲，且更具體為下列節肢動物。

半翅目(Hemiptera)：

飛蟲(飛蟲科(Delphacidae))諸如小褐飛蟲(small brown planthopper)(斑飛蟲(*Laodelphax striatellus*))、褐稻飛蟲(褐飛蟲(*Nilaparvata lugens*))、及白背稻飛蟲(白背飛蟲(*Sogatella furcifera*))；葉蟬(leafhopper)(浮塵子科(Deltocephalidae))諸如青稻葉蟬(黑尾葉蟬(*Nephotettix cincticeps*))、青稻葉蟬(二點黑尾葉蟬(*Nephotettix virescens*))、及茶小綠葉蟬(小綠葉蟬(*Empoasca onukii*))；蚜蟲(蚜科(Aphididae))諸如棉蚜(棉蚜(*Aphis gossypii*))、綠桃蚜(桃蚜(*Myzus persicae*))、甘藍蚜(甘藍蚜(*Brevicoryne brassicae*))、繡線菊蚜(spiraea aphid)(繡線菊蚜(*Aphis spiraecola*))、馬鈴薯蚜(馬鈴薯蚜(*Macrosiphum euphorbiae*))、毛地黃蚜(foxglove aphid)(茄溝無網蚜(*Aulacorthum solani*))、燕麥黍縊蚜(oat bird-cherry aphid)(禾穀縊管蚜(*Rhopalosiphum padi*))、大桔蚜(tropical citrus aphid)(桔蚜(*Toxoptera citricidus*))、及桃大尾蚜(mealy plum aphid)(桃粉蚜

(*Hyalopterus pruni*)); 臭蟲(椿科(Pentatomidae))諸如綠臭蟲(稻綠椿象(*Nezara antennata*))、豆綠椿(點蜂緣椿象(*Riptortus clavatus*))、米蟲(中華稻緣椿(*Leptocorisa chinensis*))、白斑黑臭蟲(白星椿(*Eysarcoris parvus*))、及臭蟲(大綠椿(*Halyomorpha mista*)); 粉蟲(粉蟲科(Aleyrodidae))諸如溫室白粉蟲(溫室粉蟲(*Trialeurodes vaporariorum*))、菸草粉蟲(sweetpotato whitefly)(菸草粉蟲(*Bemisia tabaci*))、柑桔粉蟲(柑桔粉蟲(*Dialeurodes citri*))、及柑桔刺粉蟲(茶黑刺粉蟲(*Aleurocanthus spiniferus*)); 介殼蟲(軟介殼蟲科(Coccidae))諸如桔紅腎圓盾介殼蟲(California red scale)(紅圓介殼蟲(*Aonidiella aurantii*))、梨圓介殼蟲(San Jose scale)(梨圓介殼蟲(*Comstockaspis perniciosa*))、北柑介殼蟲(citrus north scale)(桔矢尖介殼蟲(*Unaspis citri*))、紅臘介殼蟲(紅臘介殼蟲(*Ceroplastes rubens*))、吹綿介殼蟲(吹綿介殼蟲(*Icerya purchasi*))、日本水臘蟲(腎紋粉介殼蟲(*Planococcus kraunhiae*))、梨粉介殼蟲(Comstock mealybug)(長尾粉介殼蟲(*Pseudococcus longispinus*))、及桑白介殼蟲(white peach scale)(桑介殼蟲(*Pseudaulacaspis pentagona*)); 軍配蟲(軍配蟲科(Tingidae)); 臭蟲(cimices)諸如溫帶臭蟲(*Cimex lectularius*); 木蟲(木蟲科(Psyllidae))等;

鱗翅目(Lepidoptera):

螟蛾(螟蛾科(Pyralidae))諸如鑽心蟲(二化螟蛾

(*Chilo suppressalis*))、稻黃螟蟲(三化螟蛾(*Tryporyza incertulas*))、稻大卷葉螟(稻縱捲葉野螟蛾(*Cnaphalocrocis medinalis*))、棉大卷葉螟(棉捲葉野螟(*Notarcha derogata*))、印度粉螟(印度穀粉螟蛾(*Plodia interpunctella*))、亞洲玉米螟(*Ostrinia furnacalis*)、甘藍螟(cabbage webworm)(菜螟(*Hellula undalis*))、及早熟禾草螟(bluegrass webworm)(早熟禾草螟(*Pediasia teterrellus*))；夜蛾(夜蛾科(*Noctuidae*))諸如普通夜盜蟲(斜紋夜蛾(*Spodoptera litura*))、甜菜行軍蟲(beet armyworm)(甜菜葉蛾(*Spodoptera exigua*))、稻行軍蟲(東方黏蟲(*Pseudaletia separata*))、甘藍行軍蟲(甘藍夜蛾(*Mamestra brassicae*))、切根蟲(black cutworm)(球菜夜蛾(*Agrotis ipsilon*))、甜菜斜紋夜蛾(beet semi-looper)(黑點銀紋夜蛾(*Plusia nigrisigna*))、夜蛾屬(*Thoricoplusia* spp.)、棉鈴蟲屬(*Heliothis* spp.)、及葉蛾屬(*Helicoverpa* spp.)；紋白蝶(粉蝶科(*Pieridae*))諸如普通菜粉蝶(紋白蝶(*Pieris rapae*))；捲蛾(捲蛾科(*Tortricidae*))諸如小捲葉蛾屬(*Adoxophyes* spp.)、東方果蛾(oriental fruit moth)(梨小食心蟲(*Grapholita molesta*))、大豆食心蟲(豆捲葉螟(*Leguminivora glycinivorella*))、紅豆豆蟲(azuki bean podworm)(豆小捲葉蛾(*Matsumuraeses azukivora*))、夏果捲葉蛾(小角紋捲葉蛾(*Adoxophyes orana fasciata*))、茶小捲葉蛾(*Adoxophyes honmai*)、東方茶小捲葉蛾(茶長捲葉蛾

(*Homona magnanima*))、蘋果捲葉蛾(亂紋蘋果捲葉蛾(*Archips fuscocupreanus*))、及蠹蛾(蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella*))；潛葉蟲(細蛾科(*Gracillariidae*))諸如茶捲葉蛾(茶細蛾(*Caloptilia theivora*))、及蘋果潛葉蛾(潛葉蛾(*Phyllonorycter ringoniella*))；果蛀蛾科(*Carposinidae*)諸如桃果蛀蛾(桃小食心蟲(*Carposina niponensis*))；潛蛾(潛蛾科(*Lyonetiidae*))諸如潛蛾屬(*Lyonetia* spp.)；毒蛾(毒蛾科(*Lymantriidae*))諸如毒蛾屬(*Lymantria* spp.)、及毛蟲屬(*Euproctis* spp.)；巢蛾(巢蛾科(*Yponomeutidae*))諸如鑽石背蛾(diamondback moths)(小菜蛾(*Plutella xylostella*))；麥蛾(麥蛾科(*Gelechiidae*))諸如棉紅鈴蟲(pink bollworm)(棉紅鈴蟲(*Pectinophora gossypiella*))、及馬鈴薯管蟲(馬鈴薯塊莖蛾(*Phthorimaea operculella*))；老虎蛾及燈蛾(燈蛾科(*Arctiidae*))諸如秋幕蛾(美國白蛾(*Hyphantria cunea*))；谷蛾(谷蛾科(*Tineidae*))諸如製袋衣蛾(casemaking clothes moth)(衣蛾(*Tinea translucens*))、及織網衣蛾(webbing clothes moth)(幕衣蛾(*Tineola bisselliella*))等；

縷翅目(Thysanoptera)：

柑橘黃薊馬(Yellow citrus thrips)(西方花薊馬(*Frankliniella occidentalis*))、南黃薊馬(瓜薊馬(*Thrips palmi*))、茶黃薊馬(小黃薊馬(*Scirtothrips dorsalis*))、蔥薊馬(蔥薊馬(*Thrips tabaci*))、花薊馬(黑

腹薊馬(*Frankliniella intonsa*))等；

雙翅目(Diptera)：

蚊(蚊科(Culicidae))諸如普通蚊子(淡色庫蚊(*Culex pipiens pallens*)、三斑家蚊(*Culex tritaeniorhynchus*)、及南方家蚊(致倦庫蚊(*Culex quinquefasciatus*))；斑蚊屬(*Aedes* spp.)諸如黃熱蚊(埃及斑蚊(*Aedes aegypti*)、及亞洲虎蚊(白線斑蚊(*Aedes albopictus*))；按蚊屬(*Anopheles* spp.)諸如中華瘧蚊(*Anopheles sinensis*)；搖蚊科(Chironomidae)；家蠅(家蠅科(Muscidae))諸如家蠅(普通家蠅(*Musca domestica*))、及厩腐蠅(false stable fly)(厩腐蠅(*Muscina stabulans*))；麗蠅(麗蠅科(Calliphoridae))；麻蠅(麻蠅科(Sarcophagidae))；小家蠅(廁蠅科(Fanniidae))；花蠅(花蠅科(Anthomyiidae))諸如種蠅(seedcorn maggot)(種蠅(*Delia platura*))、及蔥蠅(onion maggot)(蔥蠅(*Delia antiqua*))；潛蠅(潛蠅科(Agromyzidae))諸如稻葉黃潛蠅(稻潛蠅(*Agromyza oryzae*))、稻葉黃潛蠅(稻潛葉蠅(*Hydrellia griseola*))、番茄斑潛蠅(蔬菜斑潛蠅(*Liriomyza sativae*))、豆潛葉蠅(非洲菊斑潛蠅(*Liriomyza trifolii*))、及豌豆潛葉蠅(豌豆潛葉蠅(*Chromatomyia horticola*))；羊蠅(稈蠅科(Chloropidae))諸如稻稈潛蠅(稻稈潛蠅(*Chlorops oryzae*))；果蠅(果實蠅科(Tephritidae))諸如瓜實蠅(瓜實蠅(*Dacus*

cucurbitae))、及地中海實蠅(Mediterranean fruit fly)(地中海實蠅(*Ceratitis capitata*))；小果蠅(果蠅科(*Drosophilidae*))；蚤蠅(蚤蠅科(*Phoridae*))諸如東亞異蚤蠅(*Megaselia spiracularis*)；蛾蚋科(*Psychodidae*)諸如毛蠓(*Clogmia albipunctata*)；蚋科(*Simuliidae*)；虻科(*Tabanidae*)諸如馬蠅(三角虻(*Tabanus trigonus*))；刺蠅(廢刺蠅(*Stomoxys*))等；

鞘翅目(*Coleoptera*)：

玉米食根蟲(corn root worms)(葉甲屬(*Diabrotica* spp.))諸如西部玉米食根蟲(玉米根葉甲(*Diabrotica virgifera virgifera*))、及南方玉米食根蟲(十一星瓜葉甲(*Diabrotica undecimpunctata howardi*))；金龜子(金龜子科(*Scarabaeidae*))諸如綠金龜(cupreous chafer)(金銅金龜(*Anomala cuprea*))、大豆甲蟲(soybean beetle)(榛姬金龜(*Anomala rufocuprea*))、及日本麗金龜(日本金龜(*Popillia japonica*))；象鼻蟲(象鼻蟲科(*Curculionidae*))諸如玉米象甲(maize weevil)(玉米象甲(*Sitophilus zeamais*))、稻水象甲(rice water weevil)(稻水象甲(*Lissorhoptrus oryzophilus*))、綠豆象甲(azuki bean weevil)(綠豆象(*Callosobruchus chinensis*))、稻象甲(rice curculio)(稻象鼻蟲(*Echinocnemus squameus*))、棉鈴象甲(boll weevil)(棉鈴象甲(*Anthonomus grandis*))、及狩獵象甲(hunting billbug)(黑楔象鼻蟲(*Sphenophorus venatus*))；擬步甲

(darkling beetles)(擬步甲科(*Tenebrionidae*))諸如黃粉蟲(yellow mealworm)(黃粉蟲(*Tenebrio molitor*))、及赤擬穀盜(red flour beetle)(赤擬穀盜(*Tribolium castaneum*))；金花蟲(金花蟲科(*Chrysomelidae*))諸如稻泥蟲(稻負泥蟲(*Oulema oryzae*))、黃守瓜(cucurbit leaf beetle)(黃守瓜(*Aulacophora femoralis*))、黃條葉蚤(striped flea beetle)(黃條葉蚤(*Phyllotreta striolata*))、及科羅拉多甲蟲(科羅拉多金花蟲(*Leptinotarsa decemlineata*))；皮蠹甲蟲(dermestid beetles)(經節蟲科(*Dermestidae*))諸如姬圓經節蟲(varied carpet beetle)(姬圓經節蟲(*Anthrenus verbasci*))、及隱蔽甲蟲(白腹皮蠹(*Dermestes maculatus*))；粉茶蛀蟲(deathwatch beetles(竊蠹科(*Anobiidae*))諸如煙草甲蟲(cigarette beetle)(煙甲蟲(*Lasioderma serricorne*))；食植瓢蟲屬(*Epilachna*)諸如茄二十八星瓢蟲(twenty-eight-spotted ladybird)(茄二十八星瓢蟲(*Epilachna vigintioctopunctata*))；樹皮甲蟲(bark beetles)(小蠹科(*Scolytidae*))諸如粉蠹蟲(powder post beetle)(褐粉蠹(*Lyctus brunneus*))、及松梢甲蟲(pine shoot beetle)(縱坑切梢小蠹(*Tomicus piniperda*))；偽粉蠹(false powderpost beetles)(長蠹蟲科(*Bostrichidae*))；蜘蛛甲(spider beetles)(蛛蠹科(*Ptinidae*))；天牛(longhorn beetles)(天牛科(*Cerambycidae*))諸如斑星天牛(white-spotted

longicorn beetle)(星天牛(*Anoplophora malasiaca*))；
叩頭蟲(叩頭蟲屬(*Agriotes* spp.))；蟻型隱翅蟲
(*Paederus fuscipes*)等；

直翅目(Orthoptera)：

亞洲蝗蟲(Asiatic locust)(飛蝗(*Locusta migratoria*))、非洲螻蛄(African mole cricket)(非洲螻蛄(*Gryllotalpa africana*))、稻蝗(小翅稻蝗(*Oxya yezoensis*))、稻蝗(日本稻蝗(*Oxya japonica*))、蟋蟀總科(Grylloidea)等；

蚤目(Siphonaptera)：

貓蚤(貓蚤(*Ctenocephalides felis*))、犬蚤(犬蚤(*Ctenocephalides canis*))、人蚤(人蚤(*Pulex irritans*))、東方鼠蚤(印度鼠蚤(*Xenopsylla cheopis*))等；

蝨目(Anoplura)：

人體蝨(人體蝨(*Pediculus humanus corporis*))、毛蝨(陰蝨(*Phthirus pubis*))、短鼻牛蝨(short-nosed cattle louse)(牛蝨(*Haematopinus eurysternus*))、羊蝨(羊蝨(*Damalinia ovis*))、豬蝨(豬蝨(*Haematopinus suis*))等；

膜翅目(Hymenoptera)：

蟻(蟻科(Formicidae))諸如小黃家蟻(*Monomorium pharaonis*)、絲光褐林蟻(*Formica fusca japonica*)、黑家蟻(無毛凹臭蟻(*Ochetellus glaber*))、雙針蟻

(*Pristomyrmex pungens*)、寬結大頭蟻(*Pheidole noda*)、切葉蟻(切葉蟻屬(*Acromyrmex* spp.))、及火蟻(火蟻屬(*Solenopsis* spp.))；黃蜂(胡蜂科(*Vespidae*))；腫腿蜂(腫腿蜂科(*Bethylidae*))；葉蜂(葉蜂科(*Tenthredinidae*))諸如甘藍葉蜂(黃翅菜葉蜂(*Athalia rosae*)、及日本菜葉蜂(*Athalia japonica*)等；

蜚蠊目(*Blattodea*)：

蟑螂(*Blattariae*)諸如德國蟑螂(德國蜚蠊(*Blattella germanica*))、煙褐蟑螂(黑胸大蠊(*Periplaneta fuliginosa*))、美洲蟑螂(美洲蜚蠊(*Periplaneta americana*))、棕色蜚蠊(*Periplaneta brunnea*)、及東方蟑螂(東方蜚蠊(*Blatta orientalis*))等；以及

白蟻(白蟻科(*Termitidae*))諸如日本散白蟻(Japanese subterranean termite)(黃胸散白蟻(*Reticulitermes speratus*))、台灣家白蟻(Formosan subterranean termite)(臺灣家白蟻(*Coptotermes formosanus*))、西方木白蟻(小楹白蟻(*Incisitermes minor*))、大黑木白蟻(截頭堆砂白蟻(*Cryptotermes domesticus*))、黑翅土白蟻(*Odontotermes formosanus*)、恆春白蟻(*Neotermes koshunensis*)、赤樹白蟻(*Glyptotermes satsumensis*)、樹白蟻(*Glyptotermes nakajimai*)、茄冬白蟻(*Glyptotermes fuscus*)、樹白蟻(*Glyptotermes kodamai*)、樹白蟻(*Glyptotermes*

kushimensis)、日本濕木白蟻(日本原白蟻(*Hodotermopsis japonica*))、家白蟻(*Coptotermes guangzhoensis*)、黑胸散白蟻(*Reticulitermes miyatakei*)、黃肢散白蟻(*Reticulitermes flavipes amamianus*)、黃胸散白蟻屬(*Reticulitermes* sp.)、高山象白蟻(*Nasutitermes takasagoensis*)、近扭白蟻(*Pericapritermes nitobei*)、台灣華扭白蟻(*Sinocapritermes mushae*)等；

蜱蟎目(Acarina)：

葉蟎(葉蟎科(Tetranychidae))諸如二點葉蟎(二斑葉蟎(*Tetranychus urticae*))、神澤葉蟎(Kanzawa spider mite)(神澤葉蟎(*Tetranychus kanzawai*))、柑桔紅蜘蛛(柑桔全爪蟎(*Panonychus citri*))、歐洲紅蟎(European red mite)(榆全爪蟎(*Panonychus ulmi*))、及小爪蟎屬(*Oligonychus* spp.)；瘿蟎(eriophyid mites)(瘿蟎科(Eriophyidae))諸如柑桔銹蟎(刺皮節蟎(*Aculops pelekassi*))、銹蟎(*Phyllocoptruta citri*)、番茄刺皮瘿蟎(番茄刺皮瘿蟎(*Aculops lycopersici*))、紫茶蟎(purple tea mite)(紫銹蟎(*Calacarus carinatus*))、茶橙瘿蟎(pink tea rust mite)(茶橙瘿蟎(*Acaphylla theavagran*))、梨銹蟎(*Eriophyes chibaensis*)、及蘋果銹蟎(蘋果斯氏刺瘿蟎(*Aculus schlechtendali*))；細蟎(tarsonemid mites)(細蟎科(Tarsonemidae))諸如茶細蟎(broad mite)(茶黃蟎(*Polyphagotarsonemus latus*))；擬葉蟎(false spider mites)(擬葉蟎科(Tenuipalpidae))

諸如紫偽葉蟎(*Brevipalpus phoenicis*)；杜克葉蟎科
 (Tuckerellidae)；蜱(硬蜱科(*Ixodidae*))諸如長角血蜱
 (*Haemaphysalis longicornis*)、血蜱(*Haemaphysalis*
flava)、台灣革蜱(*Dermacentor taiwanicus*)、美國犬蟲
 蝨(American dog tick)(變異革蜱(*Dermacentor*
variabilis))、卵形硬蜱(*Ixodes ovatus*)、全溝硬蜱
 (*Ixodes persulcatus*)、黑腿蟲蝨(黑腳硬蜱(*Ixodes*
scapularis))、孤星蟲蝨(lone star tick)(美洲花蜱
 (*Amblyomma americanum*))、微小牛蜱(*Boophilus*
microplus)、及棕色犬蟲蝨(*Rhipicephalus*
sanguineus)；癢蟎科(*Psoroptidae*)諸如耳蟎(耳癢蟎
 (*Otodectes cynotis*))；疥癬蟎(itch mites)(疥蟎科
 (*Sarcoptes*))諸如疥蟎(*Sarcoptes scabiei*)；毛囊蟲
 (follicle mites)(蠕形蟎科(*Demodicidae*))諸如犬毛囊
 蟲(犬毛囊蟲(*Demodex canis*))；粉蟎(粉蟎科(*Acaridae*))
 諸如霉蟎(mold mite)(腐食酪蟎(*Tyrophagus*
putrescentiae))、及腐食酪蟎(*Tyrophagus similis*)；家
 居塵蟎(塵蟎科(*Pyroglyphidae*))諸如美洲塵蟎
 (*Dermatophagoides farinae*)、及歐洲塵蟎
 (*Dermatophagoides pteronyssinus*)；肉食蟎(肉食蟎科
 (*Cheyletidae*))諸如普通肉食蟎(*Cheyletus eruditus*)、
 馬六甲肉食蟎(*Cheyletus malaccensis*)、及肉食蟎
 (*Cheyletus moorei*)；擬寄生蟎(parasitoid mites)(皮刺
 蟎科(*Dermanyssidae*))諸如熱帶鼠蟎(柏氏禽刺蟎

(*Ornithonyssus bacoti*))、北方禽蟎(northern fowl mite)
 (禽刺蟎(*Ornithonyssus sylviarum*))、及禽紅蟎(poultry
 red mite)(雞皮刺蟎(*Dermanyssus gallinae*))；恙蟎
 (chiggers)(恙蟎科(*Trombiculidae*))諸如紅纖恙
 (*Leptotrombidium akamushi*)；蜘蛛(真蜘蛛目(*Araneae*))
 諸如日本葉螯蛛(Japanese foliage spider)(彭妮紅螯蛛
 (*Chiracanthium japonicum*))、紅背蜘蛛(紅色蜘蛛
 (*Latrodectus hasseltii*))等；

唇足綱(*Chilopoda*)：蚰蜒(*Thereuonema*
hilgendorfi)、少棘蜈蚣(*Scolopendra subspinipes*)等；

倍足綱(*Diplopoda*)：花園馬陸(garden millipede)
 (雅麗酸馬陸(*Oxidus gracilis*))、紅色馬陸(*Nedyopus*
tambanus)等；

等足目(*Isopoda*)：普通鼠婦(common pill bug)(鼠婦
 (*Armadillidium vulgare*))等。

雖然本發明之節肢動物害蟲防治組成物可為本發明之
 化合物本身，但本發明之節肢動物害蟲防治組成物通常呈
 調配物之形式例如乳化濃縮物、油性溶液、洗髮調配物、
 流動性調配物、粉塵(dust)、可溼性粉劑、顆粒、糊狀調
 配物、微膠囊調配物、泡體調配物(foam formulation)、
 氣霧調配物(aerosol formulation)、二氧化碳氣體調配
 物、錠劑或樹脂調配物。本發明之節肢動物害蟲防治組成
 物可加工成毒餌、蚊香、電蚊香片、燻煙殺蟲劑、燻蒸劑
 或片劑後再使用。

本發明之節肢動物害蟲防治組成物通常含有 0.1 至 95 重量%之本發明化合物。

本發明之節肢動物害蟲防治組成物的調配物通常可藉由下述方法製造：將本發明之化合物與固體載劑、液體載劑及/或氣體載劑混合，且若有需要，復與界面活性劑或其他醫藥添加劑混合。

固體載劑之實例包含黏土(例如高嶺土、矽藻土、膨潤土、壽山石黏土(富巴沙黏土(Fubasami clay))或酸性黏土)之細粉或細粒、合成性水合氧化矽、滑石、陶瓷、其他無機礦物質(例如絹雲母、石英、硫、活性碳、碳酸鈣或水合氧化矽)、及化學肥料(例如硫酸銨、磷酸銨、硝酸銨、氯化銨或尿素)。

液體載劑之實例包含芳香族烴類或脂族烴類(例如二甲苯、甲苯、烷基苯、苯基二甲苯基乙烷、煤油、輕質油、己烷或環己烷)、鹵化烴類(例如氯苯、二氯甲烷、二氯乙烷或三氯乙烷)、醇類(例如甲醇、乙醇、異丙醇、丁醇、己醇或乙二醇)、醚類(例如乙醚、乙二醇二甲醚、二乙二醇單甲醚、二乙二醇單乙醚、丙二醇單甲醚、四氫呋喃或二噁烷)、酯類(例如乙酸乙酯或乙酸丁酯)、酮類(例如丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁基酮或環己酮)、腈類(例如乙腈或異丁腈)、亞砒類(例如二甲亞砒)、醯胺類(例如 N, N-二甲基甲醯胺或 N, N-二甲基乙醯胺)、吡咯啉酮類(例如 N, N-甲基-2-吡咯啉酮或 N-辛基-2-吡咯啉酮)、碳酸丙烯酯、乳酸乙酯、1, 3-二甲基-2-咪唑啉酮、植物油(例如大

豆油或棉籽油)、及植物精油(例如橙油、海索油(hyssop oil)或檸檬油)、水。

氣體載劑之實例包含丁烷氣體、氟氯碳化物、液化石油氣(LPG)、二甲醚及二氧化碳氣體。

界面活性劑之實例包含烷基硫酸鹽類、烷基磺酸鹽類、烷基芳基磺酸鹽類、烷基芳基醚類以及其聚氧乙基化(polyoxyethylated)衍生物、聚乙二醇醚類、多元醇酯類及糖醇衍生物。

其他醫藥添加劑之實例包含黏結劑、分散劑及安定劑。其具體實例包含酪蛋白、明膠、多醣類(例如澱粉、阿拉伯膠、纖維素衍生物或藻酸)、木質素衍生物、膨潤土、醣類、合成性水溶性聚合物(例如聚乙烯醇、聚乙烯吡咯啉酮或聚丙烯酸)、PAP(酸式磷酸異丙酯(isopropyl acid phosphate))、BHT(2,6-二-第三丁基-4-甲基酚)、BHA(2-第三丁基-4-甲氧基酚與3-第三丁基-4-甲氧基酚之混合物)、植物油、礦物油、脂肪酸及脂肪酸酯。

樹脂調配物之基材之實例包含氯乙烯聚合物及聚胺基甲酸酯。若有需要，可於該基材中添加塑化劑例如苯二甲酸酯(例如苯二甲酸二甲脂或苯二甲酸二辛脂)、己二酸酯或硬脂酸。該樹脂調配物係藉由使用傳統揉捏設備將本發明之化合物揉捏至基材中，接著再進行模製(例如射出成型、擠壓成型或模壓成型)而獲得。若有需要，所得之樹脂調配物可再進一步經由模製或切割等步驟塑造成平板、薄膜、條帶、網狀、細繩等形狀。此等樹脂調配物可呈例如

動物頸圈、動物耳標、片狀製品、誘引繩(lead)及園藝樁柱(horticultural supports)之形式使用。

毒餌之基材之實例包含穀粉、植物油、糖及結晶纖維素。若有需要，可於基材中添加抗氧化劑諸如二丁基羥基甲苯及去甲二氫癸創木酸(nordihydroguaiaretic acid)、防腐劑諸如去氫乙酸、防止兒童或寵物誤食毒餌之試劑諸如辣椒粉、害蟲誘引香料諸如乳酪香料、洋蔥香料或花生油等。

本發明之節肢動物害蟲防治組成物可直接施用於例如節肢動物害蟲及/或節肢動物害蟲之棲息地(例如植物體、動物體或土壤)。

當本發明之節肢害蟲防治組成物使用於防治農業和林業害蟲時，本發明化合物之施用量通常為 1 至 10,000 公克(g)/公頃(ha)，較佳為 10 至 500 g/ha。當本發明之節肢動物害蟲防治組成物呈乳化濃縮物、可溼性粉劑、流動性調配物或微膠囊調配物之形式時，通常是以水稀釋該組成物，使該組成物含有 1 至 1,000 ppm 之本發明化合物後使用。當本發明之節肢動物害蟲防治組成物呈粉塵或顆粒之形式時，通常是直接使用。本發明之節肢動物害蟲防治組成物可直接噴灑於植物，以保護該植物不受節肢動物害蟲之傷害。可使用本發明之節肢動物害蟲防治組成物處理土壤，以防治存活於土壤中之節肢動物害蟲。亦可使用本發明之節肢動物害蟲防治組成物，於種植前處理苗床，或於種植時處理植穴或植物基部(plant feet)。本發明之節肢

動物害蟲防治組成物之片狀製品可藉由纏繞於植物、設置於植物周圍、放置於植物基部的土壤表面等而施用。

本發明之節肢動物害蟲防治組成物可用於農耕地例如耕作地、稻田、草坪及果園。本發明之節肢動物害蟲防治組成物可防治農耕地中的有害節肢動物，而不會對耕種在該農耕地中的作物造成藥物傷害。

此等作物之實例包含：

農作物：玉米、稻、小麥、大麥、黑麥、燕麥、高粱、棉花、大豆、花生、蕎麥、甜菜、油菜籽、向日葵、甘蔗、菸草等；

蔬菜：茄科蔬菜(Solanaceae vegetables)(茄子、番茄、青椒、辣椒、馬鈴薯等)、葫蘆科蔬菜(Cucurbitaceae vegetables)(胡瓜、南瓜、美洲南瓜、西瓜、甜瓜等)、十字花科蔬菜(Cruciferae vegetables)(日本蘿蔔、蕪菁、辣根、球莖甘藍(kohlrabi)、中國甘藍菜、甘藍菜、黑芥(brown mustard)、青花菜、花椰菜等)、菊科蔬菜(Compositae vegetables)(牛蒡、茼蒿、朝鮮薊、萵苣等)、百合科蔬菜(Liliaceae vegetables)(蔥、洋蔥、蒜、蘆筍等)、繖形花科蔬菜(Umbelliferae vegetables)(胡蘿蔔、歐芹、芹菜、防風草(parsnip)等)、藜科蔬菜(Chenopodiaceae vegetables)(菠菜、瑞士甜菜(Swiss chard)等)、薄荷科蔬菜(Labiatae vegetables)(日本羅勒、薄荷、九層塔等)、草莓、蕃薯、山藥、芋(aroid)等；

花；

觀葉植物(Foliage plant)；

果樹：仁果類(蘋果、普通梨木、日本梨、木瓜、榲桲(quince)等)、核果類(桃、李、油桃、日本李、櫻桃、杏、棗等)、柑橘類植物(蜜柑(Satsuma mandarin)、柳橙、檸檬、萊姆、葡萄柚等)、堅果類(栗、胡桃、榛果、杏仁、開心果、腰果、夏威夷豆等)、漿果類(藍莓、蔓越莓、黑莓、覆盆子等)、葡萄、柿、橄欖、枇杷、香蕉、咖啡、椰棗、椰子等；

除了果樹以外之樹種：茶樹、桑樹、觀花樹木與灌木、行道樹(栲樹、樺樹、山茱萸、尤加利(eucalyptus)、銀杏、紫丁香、楓樹、橡樹、白楊樹、紫荊、楓香、梧桐、檫樹、日本側柏、冷杉、日本鐵杉、杜松、松樹、雲杉、紫杉)等。

上述作物包含藉由傳統育種方法或遺傳工程技術而對下列除草劑具有抗性之作物：諸如，HPPD 抑制劑(如異噁唑草酮(isoxaflutole))、ALS 抑制劑(如咪草煙(imazethapyr)和噻吩磺隆(thifensulfuron-methyl))、EPSP 合成酶抑制劑、麩醯胺合成酶抑制劑、乙醯輔酶 A 羧化酶抑制劑、以及溴苯腈(bromoxynil)。

藉由傳統育種方法而對除草劑具有抗性之作物之實例包含對咪唑啉酮(imidazolinone)除草劑如咪草煙(imazethapyr)具有抗性之 Clearfield(註冊商標)菜籽(canola)；以及對磺醯脲 ALS 抑制劑除草劑如噻吩磺隆具有抗性之 STS 大豆。對乙醯輔酶 A 羧化酶抑制劑如三酮脲

(trione oxime)除草劑或芳氧基苯氧基丙酸(aryloxy phenoxypropionic acid)除草劑具有抗性之作物之實例包含 SR 玉米。對乙醯輔酶 A 羧化酶抑制劑具有抗性之作物係見於例如 Proc. Natl. Acad. Sci. USA 1990, 87, p7175-7179。此外，已知有對乙醯輔酶 A 羧化酶抑制劑具有抗性之突變乙醯輔酶 A 羧化酶，例如，見於 Weed Science 53: p. 728-746, 2005。當藉由遺傳工程技術將編碼突變乙醯輔酶 A 羧化酶之基因導入作物時或是將提供抗性相關之突變導入作物中編碼乙醯輔酶 A 羧化酶之基因中時，可製得對乙醯輔酶 A 羧化酶抑制劑具有抗性之作物。用於導入鹼基取代突變之核酸可藉由嵌合修復術(chimeraplasty)導入作物之細胞內(參見 Gura T. 1999, Repairing the Genome's Spelling Mistakes, Science 285: 316-318)以誘發作物基因(此基因係乙醯輔酶 A 羧化酶抑制劑或除草劑的標靶)之定點(site-directed)胺基酸突變，並藉此製得對乙醯輔酶 A 羧化酶抑制劑或除草劑具有抗性之作物。

藉由遺傳工程技術而對除草劑具有抗性之作物之實例包含對嘉磷塞(glyphosate)或固殺草(glufosinate)具有抗性之玉米培育品種。一些上述玉米培育品種係以 RoundupReady(註冊商標)、LibertyLink(註冊商標)等為商品名販售。

前述作物包含藉由遺傳工程技術而有能力製造殺蟲毒素者，該殺蟲毒素為例如由芽孢桿菌(Bacillus)所產生之

選擇性毒素。

由此等遺傳工程改造植物所製造的殺蟲毒素之實例包含由仙人掌桿菌(*Bacillus cereus*)及多黏芽孢桿菌(*Bacillus popilliae*)衍生之殺蟲蛋白；由蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)衍生之殺蟲蛋白如 δ -內毒素(例如 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1 及 Cry9C)、VIP 1、VIP 2、VIP 3 及 VIP 3A；由線蟲衍生之殺蟲蛋白；由動物製造之毒素，例如蠍毒素、蜘蛛毒素、蜂毒素及昆蟲專一性神經毒素；真菌毒素；植物凝集素(lectin)；凝集素(agglutinin)；蛋白酶抑制劑，例如胰蛋白酶抑制劑、絲胺酸蛋白酶抑制劑、馬鈴薯塊莖儲藏蛋白抑制劑(patatin)、半胱胺酸蛋白酶抑制劑(cystatin)及木瓜酵素(papain)抑制劑；核糖體去活性蛋白(RIP；ribosome-inactivating protein)，例如蓖麻毒素、玉米-RIP、相思子毒素(abrin)、皂草毒素蛋白(saporin)及瀉根素(briodin)；類固醇代謝酵素，例如 3-羥基類固醇氧化酶、蛻皮類固醇-UDP-葡萄糖基轉移酶(ecdysteroid-UDP-glucosyl transferase)及膽固醇氧化酶；蛻皮激素抑制劑；HMG-CoA 還原酶；離子通道抑制劑，例如鈉離子通道抑制劑及鈣離子通道抑制劑；青春激素酯酶；利尿激素受體；二苯乙烯合成酶；聯苺基合成酶；幾丁質酶；及葡聚糖酶。

由此等遺傳工程改造植物所製造的毒素亦包含不同殺蟲蛋白(例如： δ -內毒素蛋白(例如 Cry1Ab、Cry1Ac、

Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1 及 Cry9C)、VIP 1、VIP 2、VIP 3 及 VIP 3A)之雜合毒素、部分缺失之毒素 (partly deficient toxin)以及經修飾之毒素。該雜合毒素係藉由使用遺傳工程技術組合殺蟲蛋白之不同功能域 (domain)而製得。部分缺失之毒素之實例包含已刪除部分胺基酸的 Cry1Ab。經修飾之毒素之實例包含已取代天然毒素中的一個或多個胺基酸之毒素。

該殺蟲毒素以及有能力製造殺蟲毒素之遺傳工程改造作物之實例係說明於，例如，EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451878、或 WO 03/052073。

有能力製造殺蟲毒素之遺傳工程改造作物對於鞘翅目害蟲、雙翅目害蟲或鱗翅目害蟲的攻擊特別具有抗性。

亦知具有一種或多種害蟲抗性基因並因而能製造一種或多種殺蟲毒素之遺傳工程改造植物，且該等遺傳工程改造植物中有些為市售可得者。此等遺傳工程改造植物之實例包含 YieldGard(註冊商標)(表現 Cry1Ab 毒素之玉米培育品種)、YieldGard Rootworm(註冊商標)(表現 Cry3Bb1 毒素之玉米培育品種)、YieldGard Plus(註冊商標)(表現 Cry1Ab 及 Cry3Bb1 毒素之玉米培育品種)、Heculex I(註冊商標)(表現 Cry1Fa2 毒素及磷絲菌素 N-乙酰基轉移酶 (phosphinothricin N-acetyl transferase(PAT))而對固殺草 (gluphosinate)具有抗性之玉米培育品種)、NuCOTN33B(註冊商標)(表現 Cry1Ac 毒素之棉花培育品

種)、Bollgard I(註冊商標)(表現 Cry1Ac 毒素之棉花培育品種)、Bollgard II(註冊商標)(表現 Cry1Ac 及 Cry2Ab 毒素之棉花培育品種)、VIPCOT(註冊商標)(表現 VIP 毒素之棉花培育品種)、NewLeaf(註冊商標)(表現 Cry3A 毒素之馬鈴薯培育品種)、NatureGard Agrisure GT Advantage(註冊商標)(GA21 抗草甘膦特性(GA21 glyphosate-resistance character))、Agrisure CB Advantage(註冊商標)(Bt11 玉米螟蟲(CB)特性)、以及 Protecta(註冊商標)。

上述作物包含藉由遺傳工程技術而賦予製造抗病原菌物質之能力者。

該抗病原菌物質之實例包含 PR 蛋白(PRPs, 揭露於 EP-A-0 392 225); 離子通道抑制劑, 例如鈉離子通道抑制劑及鈣離子通道抑制劑(例如由病毒製造之 KP1、KP4、或 KP6 毒素); 二苯乙烯合成酶; 聯苄基合成酶; 幾丁質酶; 葡聚糖酶; 以及由微生物製造之物質, 例如肽類抗生素、含雜環抗生素、及與植物病害抗性有關的蛋白質因子(說明於 WO 03/000906)。此等抗病原菌物質及可製造抗病原物質之遺傳工程改造植物係說明於 EP-A-0 392 225、WO 05/33818、或 EP-A-0 353 191。

當本發明之節肢動物害蟲防治組成物使用於防治流行病時, 就本發明化合物之用量而言, 當施用於空間時, 施用量通常為 0.001 至 10 毫克(mg)/立方公尺(m^3), 而當施用於平面時, 施用量通常為 0.001 至 100 毫克(mg)/平方公

尺(m^2)。當本發明之節肢動物害蟲防治組成物呈乳化濃縮物、可溼性粉劑或流動性調配物之形式時，通常是以水稀釋該組成物，使該組成物含有 0.001 至 10,000 ppm 之本發明化合物後施用。當本發明之節肢動物害蟲防治組成物呈油性溶液、氣霧調配物、煙煙殺蟲劑或毒餌時，通常是直接施用。

當本發明之節肢動物害蟲防治組成物使用於防治家畜(例如牛、馬、豬、綿羊、山羊及雞)或小型動物(例如狗、貓、大鼠及小鼠)之體外寄生蟲時，該組成物可經由獸醫領域中已知之方法施用至動物。具體言之，當欲用於全身性防治時，本發明之節肢動物害蟲防治組成物係以例如錠劑、飼料混合物、栓劑或注射劑(例如肌內注射、皮下注射、靜脈內注射、腹腔內注射等)之形式投予。當欲用於非全身性防治時，本發明之節肢動物害蟲防治組成物係藉由下述方式施用至動物：以油性溶液或水性液體形式之節肢動物害蟲防治組成物進行噴灑、澆注(pour-on)處理或滴注(spot-on)處理；以洗髮精調配物形式之節肢動物害蟲防治組成物清洗動物；或將樹脂調配物形式之節肢動物害蟲防治組成物製成頸圈或耳標以裝配於動物。當對動物投予本發明之節肢動物害蟲防治組成物時，本發明化合物之劑量通常在每 1 公斤動物體重投予 0.1 至 1,000 毫克之範圍內。

本發明之節肢動物害蟲防治組成物可與其他殺蟲劑、殺線蟲劑、殺蟎劑、殺真菌劑、除草劑、植物生長調節劑、增效劑、肥料、土壤調理劑或動物飼料混合或組合使用。

此等殺蟲劑之活性成分之實例包含：

(1) 有機磷化合物類：

毆殺松(acephate)、磷化鋁、丁硫松(butathiofos)、
硫線磷(cadusafos)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、克芬松
(chlorfenvinphos)、陶斯松(chlorpyrifos)、甲基陶斯松
(chlorpyrifos-methyl)、氰乃松(cyanophos)(CYAP)、大
利松(diazinon)、二氯異丙醚(DCIP)

(dichlorodiisopropyl ether)、酚線磷(dichlofenthion)

(ECP)、敵敵畏(dichlorvos)(DDVP)、大滅松

(dimethoate)、甲基毒蟲畏(dimethylvinphos)、二硫松

(disulfoton)、EPN、愛殺松(ethion)、普伏松

(ethoprophos)、益多松(etrifos)、芬殺松(fenthion)

(MPP)、撲滅松(fenitrothion)(MEP)、福賽絕

(fosthiazate)、福木松(formothion)、磷化氫(hydrogen

phosphide)、亞芬松(isofenphos)、加福松(isoxathion)、

馬拉松(malathion)、馬硫松(mesulfenfos)、滅大松

(methidathion)(DMTP)、亞素靈(monocrotophos)、二溴磷

(naled)(BRP)、異亞砒磷(oxydeprofos)(ESP)、巴拉松

(parathion)、裕必松(phosalone)、亞胺硫磷(phosmet)

(PMP)、甲基嘧啶磷(pirimiphos-methyl)、嗒硫磷

(pyridafenthion)、喹硫磷(quinalphos)、賽達松

(phenthoate)(PAP)、佈飛松(profenofos)、丙蟲磷

(propaphos)、普硫松(prothiofos)、白克松

(pyraclofos)、蔬果磷(salithion)、硫丙磷(sulprofos)、

丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、雙硫磷(temephos)、殺蟲畏(tetrachlorvinphos)、托福松(terbufos)、硫滅松(thiometon)、三氯松(trichlorphon)(DEP)、繁米松(vamidothion)、福瑞松(phorate)、硫線磷(cadusafos)等；

(2) 胺基甲酸酯化合物類：

棉鈴成(alanycarb)、免敵克(bendiocarb)、免扶克(benfuracarb)、BPMC、加保利(carbaryl)、克百威(carbofuran)、丁基加保扶(carbosulfan)、地蟲威(cloethocarb)、乙硫苯威(ethiofencarb)、仲丁威(fenobucarb)、芬硫克(fenothiocarb)、芬諾克(fenoxycarb)、呋線威(furathiocarb)、異丙威(isoprocarb)(MIPC)、速滅威(metolcarb)、納乃得(methomyl)、滅賜克(methiocarb)、NAC、毆殺滅(oxamyl)、抗芽威(pirimicarb)、安丹(propoxur)(PHC)、XMC、硫雙威(thiodicarb)、滅殺威(xylylcarb)、得滅克(aldicarb)等；

(3) 合成性除蟲菊精(pyrethroid)化合物類：

阿納寧(acrinathrin)、亞列寧(allethrin)、 β -賽扶寧(beta-cyfluthrin)、畢芬寧(bifenthrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、賽滅寧(cypermethrin)、益避寧(empenthrin)、第滅寧(deltamethrin)、益化利(esfenvalerate)、醚菊酯(ethofenprox)、芬普寧

(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、護賽寧(flucythrinate)、伏芬普斯(flufenoprox)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、福化利(fluvalinate)、合芬寧(halfenprox)、益普靈(imiprothrin)、百滅寧(permethrin)、普亞列寧(prallethrin)、除蟲菊酯(pyrethrins)、異列滅寧(resmethrin)、 σ -賽滅寧(sigma-cypermethrin)、矽護芬(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin)、泰滅寧(tralomethrin)、拜富寧(transfluthrin)、治滅寧(tetramethrin)、苯醚菊酯(phenothrin)、賽酚寧(cyphenothrin)、 α -賽滅寧(alpha-cypermethrin)、 ζ -賽滅寧(zeta-cypermethrin)、 λ -賽洛寧(lambda-cyhalothrin)、 γ -賽洛寧(gamma-cyhalothrin)、伏滅靈(furamethrin)、 τ -福化利(tau-fluvalinate)、美特寧(metofluthrin)、2,2-二甲基-3-(1-丙烯基)環丙烷羧酸 2,3,5,6-四氟-4-甲基苯甲酯、2,2-二甲基-3-(2-甲基-1-丙烯基)環丙烷羧酸 2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苯甲酯、2,2-二甲基-3-(2-氟基-1-丙烯基)環丙烷羧酸 2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苯甲酯、2,2,3,3-四甲基環丙烷羧酸 2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苯甲酯等；

(4) 沙蠶毒素(nereistoxin)化合物類：

培丹(cartap)、免速達(bensultap)、殺蟲環(thiocyclam)、殺蟲單(monosultap)、殺蟲雙(bisultap)等；

(5) 新類尼古丁(neonicotinoid)化合物類：

益達胺(imidacloprid)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、亞滅培(acetamiprid)、噻蟲嗪(thiamethoxam)、噻蟲啉(thiacloprid)、達特南(dinotefuran)、可尼丁(clothianidin)等；

(6) 苯甲醯基脲化合物類：

克福隆(chlorfluazuron)、雙三氟蟲脲(bistrifluron)、汰芬隆(diafenthiuron)、除蟲脲(di-flubenzuron)、氟啶蟬脲(flucycloxuron)、氟環脲(flucycloxuron)、氟芬隆(flufenoxuron)、六伏隆(hexaflumuron)、祿芬隆(lufenuron)、諾伐隆(novaluron)、多氟蟲醯脲(noviflumuron)、得福隆(teflubenzuron)、殺鈴脲(triflumuron)、三唑隆(triazuron)等；

(7) 苯基吡唑化合物類：

乙醯蟲脞(acetoprole)、乙蟲清(ethiprole)、芬普尼(fipronil)、吡咯胺(vaniliprole)、氟蟲脞(pyriprole)、丁烯氟蟲脞(pyrafluprole)等；

(8) Bt 毒素殺蟲劑：

由蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)所產生之活孢子或結晶毒素，以及其混合物；

(9) 肼化合物類：

可芬諾(chromafenozide)、氣蟲醯肼(halofenozide)、滅芬諾(methoxyfenozide)、抑蟲肼

(tebufenozide)等；

(10) 有機氯化化合物類：

阿特靈(aldrin)、地特靈(dieldrin)、除蟎靈(dienochlor)、硫丹(endosulfan)、甲氧基氯(methoxychlor)等；

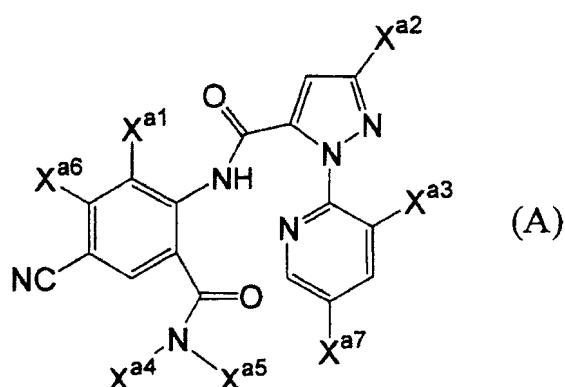
(11) 天然殺蟲劑：

機油、菸鹼硫酸鹽等；

(12) 其他殺蟲劑：

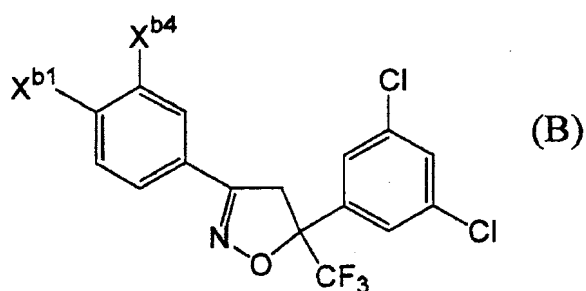
阿維菌素-B (avermectin-B)、溴蟎酯(bromopropylate)、布芬淨(buprofezin)、溴蟲清(chlorphenapyr)、滅蠅胺(cyromazine)、D-D (1,3-二氯丙烯)、因滅丁(emamectin-benzoate)、芬殺蟎(fenazaquin)、吡氟硫磷(flupyrzofos)、烯蟲乙酯(hydroprene)、美賜年(methoprene)、因得克(indoxacarb)、滅塔松(methoxadiazone)、倍脈心-A(milbemycin-A)、派滅淨(pymetrozine)、啖蟲丙醚(pyridalyl)、百利普芬(pyriproxyfen)、賜諾殺(spinosad)、氟蟲胺(sulfluramid)、啞蟲醯胺(tolfenpyrad)、啞蚱威(triazamate)、氟蟲醯胺(flubendiamide)、彌拜菌素(lepimectin)、砷酸(arsenic acid)、苯克賽(benclothiaz)、氰胺化鈣(calcium cyanamide)、多硫化鈣(calcium polysulfide)、可氯丹(chlordane)、DDT、DSP、伏芬靈(flufenerim)、氟尼胺(flonicamid)、氟蟲芬(flurimfen)、覆滅蟎

(formetanate)、安百畝(metam-ammonium)、威百畝(metam-sodium)、溴化甲烷、油酸鉀、普奇芬(protrifenbute)、螺甲蟊酯(spiromesifen)、硫、氰氟蟲腓(metaflumizone)、螺蟲乙酯(spirotetramat)、必克松(pyrifluquinazone)、多殺菌素(spinetoram)、氯蟲醯胺(chlorantraniliprole)、滅釘螺(tralopyril)、下式(A)所示之化合物：



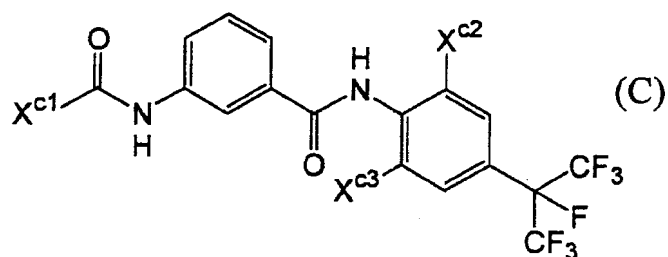
式中， X^{a1} 表示甲基、氯原子、溴原子或氟原子， X^{a2} 表示氟原子、氯原子、溴原子、C1-C4 鹵烷基或 C1-C4 鹵烷氧基， X^{a3} 表示氟原子、氯原子或溴原子， X^{a4} 表示視需要經取代之 C1-C4 烷基、視需要經取代之 C3-C4 烯基、視需要經取代之 C3-C4 炔基、視需要經取代之 C3-C5 環烷基烷基或氫原子， X^{a5} 表示氫原子或甲基， X^{a6} 表示氫原子、氟原子或氯原子，及 X^{a7} 表示氫原子、氟原子或氯原子；

下式(B)所示之化合物：



式中， X^{b1} 表示 $X^{b2}-NH-C(=O)$ 基團、 $X^{b2}-C(=O)-NH-CH_2-$ 基團、 $X^{b3}-S(O)$ 基團、視需要經取代之吡咯-1-基、視需要經取代之咪唑-1-基、視需要經取代之吡唑-1-基、或視需要經取代之 1,2,4-三唑-1-基， X^{b2} 表示視需要經取代之 C1-C4 鹵烷基例如 2,2,2-三氟乙基、或視需要經取代之 C3-C6 環烷基例如環丙基， X^{b3} 表示視需要經取代之 C1-C4 烷基例如甲基，及 X^{b4} 表示氫原子、氯原子、氟基或甲基；

下式(C)所示之化合物：



式中， X^{c1} 表示視需要經取代之 C1-C4 烷基例如 3,3,3-三氟丙基、視需要經取代之 C1-C4 烷氧基例如 2,2,2-三氟乙氧基、視需要經取代之苯基例如 4-氟基苯基、或視需要經取代之吡啶基例如 2-氯-3-吡啶基， X^{c2} 表示甲基或三氟甲硫基，及 X^{c3} 表示甲基或鹵素原子。

殺蟎劑之活性成分之實例包含亞醯蟎

(acequinocyl)、三亞蟎(amitraz)、苯蟎特

(benzoximate)、聯苯肼酯(bifenazate)、溴蟎酯

(bromopropylate)、蟎離丹(chinomethionat)、克氯苯

(chlorobenzilate)、殺蟎酯 CPCBS (chlorfenson)、四蟎

嗪(clofentezine)、丁氟蟎酯(cyflumetofen)、大克蟎

(kelthane)(dicofol)、依殺蟎(etoxazole)、芬佈賜

(fenbutatin oxide)、芬硫克(fenothiocarb)、芬普蟎(fenpyroximate)、嘧蟎酯(fluacrypyrim)、苜蟎醚(fluproxyfen)、合賽多(hexythiazox)、毆蟎多(propargite)(BPPS)、殺蟎黴素(polynactins)、畢達本(pyridaben)、畢汰芬(pyrimidifen)、吡蟎胺(tebufenpyrad)、三氯殺蟎磺(tetradifon)、季酮蟎酯(spirodiclofen)、表螺甲蟎酯(spiromesifen)、螺蟲乙酯(spirotetramat)、安伏滅(amidoflumet)、及氰普凡(cyenopyrafen)。

殺線蟲劑之活性成分之實例包括 DCIP、福賽絕(fosthiazate)、左美索(levamisol)、甲基異硫氰酸酯(methylisothiocyanate)、摩朗得酒石酸鹽(morantel tartarate)、及依米塞扶(imicyafos)。

殺真菌劑之活性成分之實例包含司托必靈(strobilurin)化合物類諸如亞托敏(azoxystrobin)；有機磷酸酯化合物類諸如脫克松(tolclofos-methyl)；唑(azole)化合物類諸如賽福座(triflumizole)、披扶座(pefurazoate)及待克利(difenoconazole)；熱必斯(fthalide)、福多寧(flutolanil)、維利黴素(validamycin)、撲殺熱(probenazole)、達滅淨(diclomezine)、賓克隆(pencycuron)、邁隆(dazomet)、嘉賜黴素(kasugamycin)、IBP、百快隆(pyroquilon)、歐索林酸(oxolinic acid)、三賽唑(tricyclazole)、富米熱斯(ferimzone)、滅普寧(mepronil)、EDDP、亞賜圃

(isoprothiolane)、加普胺(carpropamid)、雙氯氰菌胺(diclocymet)、福拉比(furametpyr)、護汰寧(fludioxonil)、撲滅寧(procymidone)及乙徽威(diethofencarb)。

除草劑、植物生長調節劑、增效劑、肥料、土壤調理劑或動物飼料並無限制，可使用傳統已知之除草劑、植物生長調節劑、增效劑、肥料、土壤調理劑或動物飼料。

後文中，本發明係藉由製備例、調配例及試驗例更詳細說明。然而，本發明並不以該等實施例為限。

本文所使用之縮寫具有下列含義。

Me：甲基，Et：乙基，Bn：苯甲基，Ph：苯基，Ts：對甲苯磺醯基以及 Ac：乙醯基。

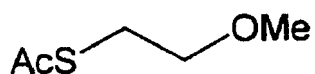
首先，顯示本發明化合物之製備例。

參考製備例 1

[步驟 1-1]

於 0°C 和氮氣氛圍下，以 15 分鐘時間將 7.73 公克 1-氯-2-甲氧基乙烷滴加至 10.28 公克硫乙酸鉀(potassium thioacetate)之 80 毫升(mL)N,N-二甲基甲醯胺懸浮液中，隨後於室溫攪拌 1 小時。將反應混合物加熱至 60°C 後，攪拌 4 小時，接著冷卻至室溫，依序將 100 毫升乙酸乙酯和 100 毫升 1N 鹽酸水溶液加至其中。自混合物分離有機層。水層以 100 毫升乙酸乙酯萃取，共兩次。合併有機層，依序以 30 毫升 1N 鹽酸水溶液、100 毫升飽和碳酸氫鈉水溶液以及 100 毫升飽和鹽水清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過

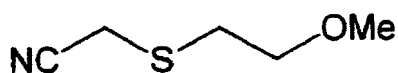
濾，並於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 10.12 公克下式所示之硫乙酸 S-(2-甲氧基乙酯)。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 2.34 (3H, s), 3.09 (2H, t), 3.37 (3H, s), 3.52 (2H, t)

[步驟 1-2]

將 10.12 公克硫乙酸 S-(2-甲氧基乙酯)之 80 毫升四氫呋喃溶液冷卻至 0°C 。以 15 分鐘時間將 15.62 公克 28% 甲醇鈉溶液滴加至溶液中，隨後於室溫攪拌 1 小時。於 0°C ，將 6.07 公克氯乙腈加至混合物中，隨後於室溫攪拌 4 小時。使反應混合物於冰浴中冷卻，並將 100 毫升飽和氯化鈉水溶液加至其中。接著，混合物以 100 毫升第三丁基甲基醚萃取，共兩次。合併有機層，以飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，隨後於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 4.10 公克下式所示之(2-甲氧基乙硫基)乙腈。

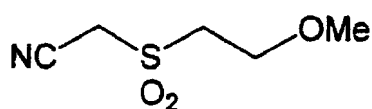


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 2.92 (2H, t), 3.39 (3H, s), 3.43 (2H, s), 3.70 (2H, t)

[步驟 1-3]

於 0°C 和氮氣氛圍下，以 30 分鐘時間將 4.10 公克(2-甲氧基乙硫基)乙腈之 60 毫升甲醇溶液滴加至 19.16 公克 $2\text{KHSO}_5 \cdot \text{KHSO}_4 \cdot \text{K}_2\text{SO}_4$ 複鹽(Oxone(註冊商標))之 60 毫升水懸浮液中，隨後於室溫攪拌 1 小時。將反應混合物加熱至

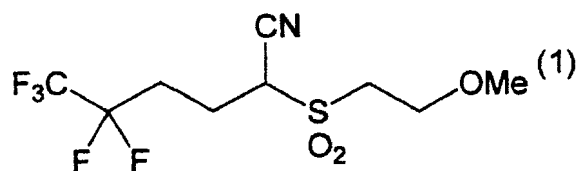
50°C 後，攪拌 2 小時。使反應混合物於冰浴中冷卻後，將 80 毫升 10% 亞硫酸鈉水溶液加至其中。於減壓下自混合物蒸餾移除甲醇後，以 100 毫升乙酸乙酯萃取混合物共兩次。合併有機層，依序以 40 毫升 10% 亞硫酸鈉水溶液和 50 毫升飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，隨後於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 2.88 公克下式所示之 (2-甲氧基乙磺基) 乙腈。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 3.43 (3H, s), 3.45 (2H, t), 3.86 (2H, t), 4.13 (2H, s)

製備例 1

將 1.38 公克碳酸鉀和 2.74 公克 1-碘-3,3,4,4,4-五氟丁烷加至參考製備例 1 所獲得之 1.63 公克 (2-甲氧基乙磺基) 乙腈之 10 毫升 N,N-二甲基甲醯胺溶液中，隨後於室溫攪拌 1 小時。將反應混合物加熱至 70°C 後，攪拌 4 小時。使反應混合物冷卻至室溫後，依序加入 30 毫升乙酸乙酯和 30 毫升 1N 鹽酸水溶液。自混合物分離有機層，並將水層以 30 毫升乙酸乙酯萃取，共兩次。合併有機層，依序以 30 毫升 1N 鹽酸水溶液、30 毫升飽和碳酸氫鈉水溶液以及 30 毫升飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，接著於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 0.89 公克下式所示之 5,5,6,6,6-五氟-2-(2-甲氧基乙磺基) 己腈 (後文中，稱為本發明化合物(1))。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 2.27-2.60 (4H, m), 3.20-3.27 (1H, m), 3.45 (3H, s), 3.74-3.85 (2H, m), 3.90-3.97 (1H, m), 4.37-4.42 (1H, m)

參考製備例 2

[步驟 2-1]

於室溫和氮氣氛圍下，將 5.88 公克硫乙酸鉀加至 11.17 公克對甲苯磺酸 3-甲氧基丙酯之 25 毫升 N,N-二甲基甲醯胺溶液中，隨後攪拌 2 小時。將反應混合物加熱至 50°C ，攪拌 30 分鐘，隨後冷卻至室溫。依序將 40 毫升乙酸乙酯和 70 毫升 1N 鹽酸水溶液加至混合物中。分離有機層，並以 40 毫升乙酸乙酯萃取水層三次。合併有機層，依序以 100 毫升 1N 鹽酸水溶液、30 毫升飽和碳酸氫鈉水溶液以及 30 毫升飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，接著於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 6.06 公克下式所示之硫乙酸 S-(3-甲氧基丙酯)。

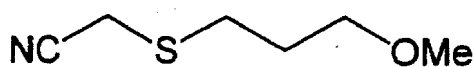


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 1.84 (2H, tt), 2.33 (3H, s), 2.95 (2H, t), 3.33 (3H, s), 3.42 (2H, t)

[步驟 2-2]

將 6.06 公克硫乙酸 S-(3-甲氧基丙酯)之 40 毫升四氫呋喃溶液冷卻至 0°C 。以 15 分鐘時間將 7.87 公克含有 28% 甲醇鈉之甲醇溶液滴加至其中，隨後於室溫攪拌 30 分鐘。

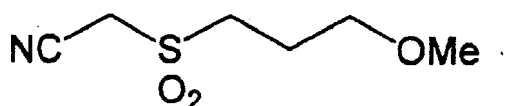
於 0°C 將 3.08 公克氯乙腈加至混合物中，隨後於室溫攪拌 18 小時。使反應混合物於冰浴中冷卻後，將 50 毫升飽和氯化鈉水溶液加至其中。混合物以 50 毫升乙酸乙酯萃取，共三次。合併有機層，以 50 毫升飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，接著於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 4.47 公克下式所示之(3-甲氧基丙硫基)乙腈。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 1.93 (2H, tt), 2.84 (2H, t), 3.30 (2H, s), 3.35 (3H, s), 3.49 (2H, t)

[步驟 2-3]

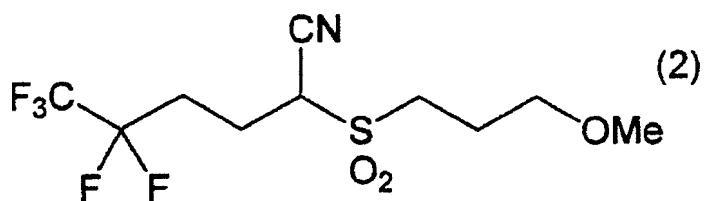
於 0°C 和氮氣氛圍下，以 30 分鐘時間將 4.47 公克(3-甲氧基丙硫基)乙腈之 50 毫升甲醇溶液滴加至 22.65 公克 $2\text{KHSO}_5 \cdot \text{KHSO}_4 \cdot \text{K}_2\text{SO}_4$ 複鹽(Oxone(註冊商標))之 90 毫升水懸浮液中，隨後於室溫攪拌 3 小時。使反應混合物於冰浴中冷卻，並將 50 毫升 10%亞硫酸鈉水溶液加至其中。於減壓下自混合物蒸餾移除甲醇後，以 100 毫升乙酸乙酯萃取混合物，共三次。合併有機層，依序以 20 毫升 10%亞硫酸鈉水溶液和 50 毫升飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，接著於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 4.92 公克下式所示之(3-甲氧基丙磺基)乙腈。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 2.18 (2H, tt), 3.37 (3H, s), 3.41 (2H, t), 3.54 (2H, t), 4.03 (2H, s)

製備例 2

將 0.43 公克碳酸鉀和 0.85 公克 1-碘-3,3,4,4,4-五氟丁烷加至參考製備例 2 所獲得之 0.50 公克(3-甲氧基丙磺醯基)乙腈之 6 毫升 N,N-二甲基甲醯胺溶液中，隨後於室溫攪拌 2 小時。將反應混合物加熱至 50°C ，攪拌 2.5 小時。使反應混合物冷卻至室溫後，依序加入 30 毫升乙酸乙酯和 10 毫升 1N 鹽酸水溶液。自混合物分離有機層，並將水層以 30 毫升乙酸乙酯萃取，共兩次。合併有機層，依序以 10 毫升 1N 鹽酸水溶液和 10 毫升飽和碳酸氫鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，接著於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 0.69 公克下式所示之 5,5,6,6,6-五氟-2-(3-甲氧基丙磺醯基)己腈(後文中，稱為本發明化合物(2))。



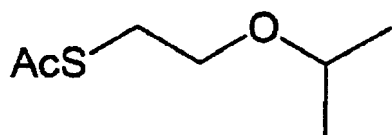
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 2.21 (2H, tt), 2.43 (4H, m), 3.37 (3H, s), 3.42-3.46 (2H, m), 3.49-3.59 (2H, m), 4.09-4.12 (1H, m)

參考製備例 3

[步驟 3-1]

於室溫和氮氣氛圍下，將 16.82 公克硫乙酸鉀加至 36.25 公克對甲苯磺酸(2-異丙氧基乙酯)之 70 毫升 N,N-

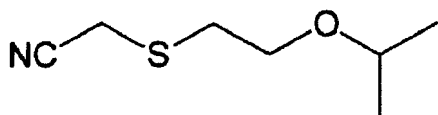
二甲基甲醯胺溶液中，隨後攪拌 1 小時。將反應混合物加熱至 60°C，攪拌 4 小時，並冷卻至室溫。依序將 150 毫升乙酸乙酯和 300 毫升 1N 鹽酸水溶液加至其中。自混合物分離有機層，並將水層以 150 毫升乙酸乙酯萃取，共兩次。合併有機層，依序以 100 毫升 1N 鹽酸水溶液、100 毫升飽和碳酸氫鈉水溶液以及 100 毫升飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，接著於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 13.56 公克下式所示之硫乙酸 S-(2-異丙氧基乙酯)。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 1.15 (6H, d), 2.34 (3H, s), 3.07 (2H, t), 3.54 (2H, t), 3.60 (1H, qq),

[步驟 3-2]

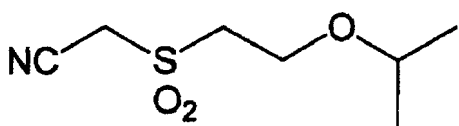
將 13.56 公克硫乙酸 S-(2-異丙氧基乙酯)之 80 毫升四氫呋喃溶液冷卻至 0°C，並以 15 分鐘時間將 16.01 公克含有 28% 甲醇鈉之甲醇溶液滴加至其中，隨後於室溫攪拌 1 小時。於 0°C，將 6.27 公克氯乙腈加至混合物中，隨後於室溫攪拌 4 小時。使反應混合物於冰浴中冷卻後，將飽和氯化鈉水溶液加至其中。接著，將混合物以 100 毫升第三丁基甲基醚萃取，共兩次。合併有機層，以飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，接著於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 12.39 公克下式所示之(2-異丙氧基乙硫基)乙腈。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 1.18 (6H, d), 2.90 (2H, t), 3.47 (2H, s), 3.60 (1H, qq), 3.72 (2H, t)

[步驟 3-3]

於 0°C 和氮氣氛圍下，以 30 分鐘時間將 12.39 公克(2-異丙氧基乙硫基)乙腈之 80 毫升甲醇溶液滴加至 51.00 公克 $2\text{KHSO}_5 \cdot \text{KHSO}_4 \cdot \text{K}_2\text{SO}_4$ 複鹽(Oxone(註冊商標))之 80 毫升水懸浮液中，隨後於室溫攪拌 1 小時。將反應混合物加熱至 50°C ，並且攪拌 2 小時。使反應混合物於冰浴中冷卻後，於其中加入 100 毫升 10%亞硫酸鈉水溶液。於減壓下自混合物蒸餾移除甲醇後，以 100 毫升乙酸乙酯萃取混合物兩次。合併有機層，依序以 50 毫升 10%亞硫酸鈉水溶液和 50 毫升飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，接著於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 14.13 公克下式所示之(2-異丙氧基乙磺基)乙腈。

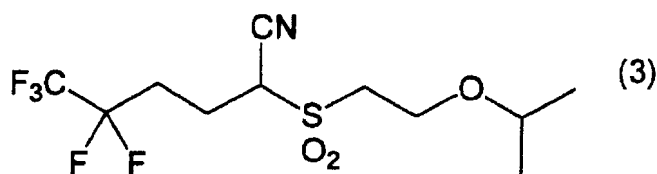


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 1.20 (6H, d), 3.44 (2H, t), 3.69 (1H, qq), 3.88 (2H, t), 4.17 (2H, s)

製備例 3

將 1.38 公克碳酸鉀和 2.74 公克 1-碘-3,3,4,4,4-五氟丁烷加至參考製備例 3 所獲得之 1.91 公克(2-異丙氧基乙磺基)乙腈之 10 毫升 N,N-二甲基甲醯胺溶液中，隨後於室溫攪拌 1 小時。將反應混合物加熱至 70°C ，並攪拌 4

小時。使反應混合物冷卻至室溫後，依序將 30 毫升乙酸乙酯和 30 毫升 1N 鹽酸水溶液加至其中。自混合物分離有機層，並將水層以 30 毫升乙酸乙酯萃取，共兩次。合併有機層，依序以 30 毫升 1N 鹽酸水溶液、30 毫升飽和碳酸氫鈉水溶液以及 30 毫升飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，接著於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 1.03 公克下式所示之 5,5,6,6,6-五氟-2-(2-異丙氧基乙磺基)己腈(後文中，稱為本發明化合物(3))。

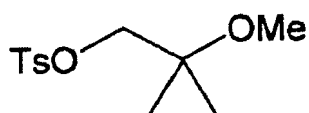


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 1.17 (3H, d), 1.19 (3H, d), 2.26-2.61 (4H, m), 3.20-3.26 (1H, m), 3.62-3.72 (1H, m), 3.75-3.85 (2H, m), 3.92-3.99 (1H, m), 4.52-4.58 (1H, m)

參考製備例 4

[步驟 4-1]

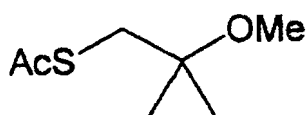
將 21.49 公克對甲苯磺醯氯加至 11.72 公克 2-甲氧基-2-甲基-1-丙醇之 50 毫升吡啶溶液中，隨後於室溫攪拌隔夜。在反應混合物中依序加入 150 毫升乙酸乙酯和 150 毫升 1N 鹽酸水溶液。自混合物分離有機層，並將水層以 100 毫升乙酸乙酯萃取，共兩次。合併有機層，依序以 50 毫升 1N 鹽酸水溶液、100 毫升飽和碳酸氫鈉水溶液以及 100 毫升飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，接著於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 26.14 公克下式所示之對甲苯磺酸(2-甲氧基-2-甲基丙酯)。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 1.15 (6H, s), 2.46 (3H, s), 3.16 (3H, s), 3.85 (2H, s), 7.34 (2H, d), 7.80 (2H, d)

[步驟 4-2]

於氮氣氛圍下，將 26.14 公克對甲苯磺酸(2-甲氧基-2-甲基丙酯)加至 11.56 公克硫乙酸鉀之 100 毫升 N,N-二甲基甲醯胺懸浮液中，隨後於室溫攪拌 1 小時。將反應混合物加熱至 70°C ，攪拌 48 小時，隨後冷卻至室溫。依序將 200 毫升甲基第三丁基醚(後文中，稱為 MTBE)和 100 毫升 1N 鹽酸水溶液加至其中。自混合物分離有機層，水層以 100 毫升 MTBE 萃取，共兩次。合併有機層，依序以 30 毫升 1N 鹽酸水溶液、100 毫升飽和碳酸氫鈉水溶液以及 100 毫升飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，並於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 8.92 公克下式所示之硫乙酸 S-(2-甲氧基-2-甲基丙酯)。

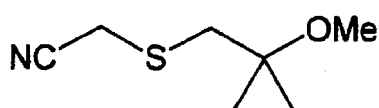


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 1.21 (6H, s), 2.37 (3H, s), 3.12 (2H, s), 3.19 (3H, s)

[步驟 4-3]

將 8.92 公克硫乙酸 S-(2-甲氧基-2-甲基丙酯)之 55 毫升四氫呋喃溶液冷卻至 0°C 。以 15 分鐘時間將 10.61 公克含有 28% 甲醇鈉之甲醇溶液滴加至其中，隨後於室溫攪拌 1 小時。於 0°C ，將 4.15 公克氯乙腈加至混合物中，隨

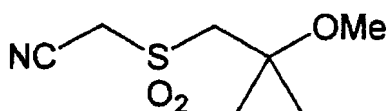
後於室溫攪拌 4 小時。使反應混合物於冰浴中冷卻，並將 50 毫升飽和氯化鈉水溶液加至其中。接著，將混合物以 50 毫升乙酸乙酯萃取，共兩次。合併有機層，以 50 毫升飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，接著於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 8.25 公克下式所示之(2-甲氧基-2-甲基丙硫基)乙腈。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 1.29 (6H, s), 2.83 (2H, s), 3.22 (3H, s), 3.41 (2H, s)

[步驟 4-4]

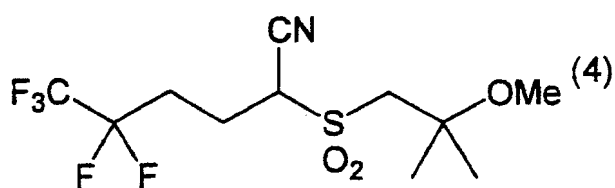
於 0°C 和氮氣氛圍下，以 30 分鐘時間將 8.25 公克(2-甲氧基-2-甲基丙硫基)乙腈之 120 毫升甲醇溶液滴加至 37.15 公克 $2\text{KHSO}_5 \cdot \text{KHSO}_4 \cdot \text{K}_2\text{SO}_4$ 複鹽(Oxone(註冊商標))之 120 毫升水懸浮液中，隨後於室溫攪拌 4 小時。反應混合物加熱至 50°C ，並且攪拌 1 小時。使反應混合物於冰浴中冷卻，並將 80 毫升 10%亞硫酸鈉水溶液加至其中。於減壓下自混合物蒸餾移除甲醇後，以 100 毫升乙酸乙酯萃取混合物三次。合併有機層，依序以 40 毫升 10%亞硫酸鈉水溶液和 50 毫升飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，接著於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 9.18 公克下式所示之(2-甲氧基-2-甲基丙磺基)乙腈。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 1.43 (6H, s), 3.30 (3H, s), 3.38 (2H, s), 4.15 (2H, s)

製備例 4

將 0.69 公克碳酸鉀和 1.37 公克 1-碘-3,3,4,4,4-五氟丁烷加至參考製備例 4 所獲得之 0.96 公克(2-甲氧基-2-甲基丙磺醯基)乙腈之 5 毫升 N,N-二甲基甲醯胺溶液中，隨後於室溫攪拌 1 小時。將反應混合物加熱至 70°C ，並攪拌 4 小時。使混合物冷卻至室溫後，依序於其中加入 30 毫升乙酸乙酯和 30 毫升 1N 鹽酸水溶液。自混合物分離有機層，並將水層以 30 毫升乙酸乙酯萃取，共兩次。合併有機層，依序以 30 毫升 1N 鹽酸水溶液、30 毫升飽和碳酸氫鈉水溶液以及 30 毫升飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，接著於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 0.87 公克下式所示之 5,5,6,6,6-五氟-2-(2-甲氧基-2-甲基丙磺醯基)己腈(後文中，稱為本發明化合物(4))。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 1.37 (3H, s), 1.48 (3H, s), 2.29-2.56 (4H, m), 3.16 (1H, d), 3.28 (3H, s), 3.69 (1H, d), 4.51 (1H, t)

參考製備例 5

[步驟 5-1]

將 30.44 公克 2-巰基乙醇之 200 毫升四氫呋喃溶液冷

卻至 0℃，並以 30 分鐘時間將 75.24 公克含有 28% 甲醇鈉之甲醇溶液滴加至其中，隨後於室溫攪拌 1 小時。於 0℃，將 29.22 公克氯乙腈加至混合物中，隨後於室溫攪拌隔夜。使反應混合物於冰浴中冷卻，並將 50 毫升飽和氯化鈉水溶液加至其中。混合物接著以 100 毫升乙酸乙酯萃取，共三次。合併有機層，以 100 毫升飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，接著於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 45.00 公克下式所示之(2-羥基乙硫基)乙腈。

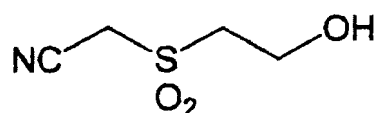


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 2.95 (2H, t), 3.42 (2H, s), 3.93 (2H, t)

[步驟 5-2]

於 0℃ 和氮氣氛圍下，以 30 分鐘時間將 5.86 公克(2-羥基乙硫基)乙腈之 100 毫升甲醇溶液滴加至 33.77 公克 $2\text{KHSO}_5 \cdot \text{KHSO}_4 \cdot \text{K}_2\text{SO}_4$ 複鹽(Oxone(註冊商標))之 100 毫升水懸浮液中，隨後於室溫攪拌 4 小時。將反應混合物加熱至 50℃，並且攪拌 1 小時。使混合物於冰浴中冷卻，並將 60 毫升 10% 亞硫酸鈉水溶液加至其中。接著，於減壓下自混合物蒸餾移除甲醇，並以 100 毫升乙酸乙酯萃取混合物三次。合併有機層，依序以 30 毫升 10% 亞硫酸鈉水溶液和 50 毫升飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，接著於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 4.16

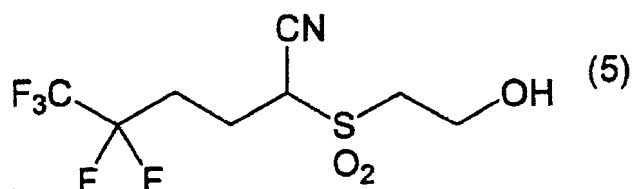
公克下式所示之(2-羥基乙磺醯基)乙腈。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 3.48 (2H, t), 4.20 (2H, s), 4.21 (2H, t)

製備例 5

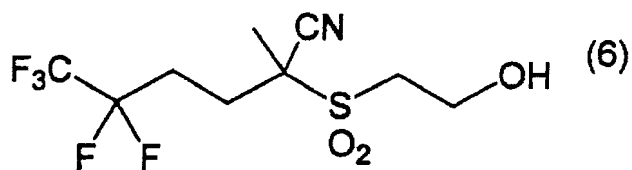
將 3.85 公克碳酸鉀和 7.64 公克 1-碘-3, 3, 4, 4, 4-五氟丁烷加至參考製備例 5 所獲得之 4.16 公克(2-羥基乙磺醯基)乙腈之 30 毫升 N, N-二甲基甲磺胺溶液中，隨後於室溫攪拌 4 小時。將反應混合物加熱至 50°C ，並攪拌 5 小時。使反應混合物冷卻至室溫後，依序將 150 毫升乙酸乙酯和 150 毫升 1N 鹽酸水溶液加至其中。自混合物分離有機層，並將水層以 100 毫升乙酸乙酯萃取，共兩次。合併有機層，依序以 50 毫升 1N 鹽酸水溶液、50 毫升飽和碳酸氫鈉水溶液以及 50 毫升飽和鹽水清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，接著於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 2.36 公克下式所示之 5, 5, 6, 6, 6-五氟-2-(2-羥基乙磺醯基)己腈(後文中，稱為本發明化合物(5))。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 2.23-2.57 (5H, m), 3.25-3.33 (1H, m), 3.75-3.83 (1H, m), 4.16-4.30 (2H, m), 4.44-4.48 (1H, m)

製備例 6

將 1.03 公克碳酸鉀和 1.06 公克碘甲烷加至 1.48 公克本發明化合物(5)之 5 毫升 N,N-二甲基甲醯胺溶液中，隨後於室溫攪拌 1 小時。將反應混合物加熱至 70°C，並攪拌 4 小時。使混合物冷卻至室溫，並依序將 30 毫升乙酸乙酯和 30 毫升 1N 鹽酸水溶液加至其中。分離有機層，並將水層以 30 毫升乙酸乙酯萃取，共兩次。合併有機層，依序以 30 毫升 1N 鹽酸水溶液、30 毫升飽和碳酸氫鈉水溶液以及 30 毫升飽和鹽水清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，接著於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 1.18 公克下式所示之 5,5,6,6,6-五氟-2-(2-羥基乙磺醯基)-2-甲基己腈(後文中，稱為本發明化合物(6))。

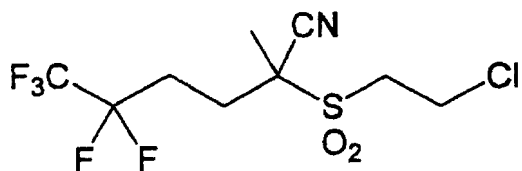


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 1.82 (3H, s), 2.14-2.61 (5H, m), 3.47-3.64 (2H, m), 4.23-4.32 (2H, m)

製備例 7

[步驟 7-1]

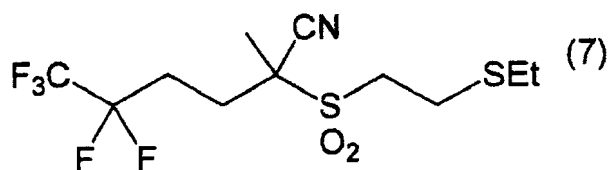
將 3.36 公克本發明化合物(6)之 20 毫升亞硫醯氯溶液於迴流下加熱 6 小時。使反應混合物冷卻至室溫，並於減壓下蒸餾移除亞硫醯氯。在殘留物中加入 20 毫升己烷，於減壓下濃縮，並且重覆此操作兩次。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 3.52 公克下式所示之 5,5,6,6,6-五氟-2-(2-氯乙磺醯基)-2-甲基己腈。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 1.81 (3H, s), 2.14-2.27 (4H, m), 3.62-3.76 (2H, m), 4.57-4.71 (2H, m)

[步驟 7-2]

將 0.10 公克乙硫醇鈉加至 0.30 公克 5,5,6,6,6-五氟-2-(2-氯乙磺基)-2-甲基己腈之 1 毫升 N,N-二甲基甲醯胺溶液中，隨後於室溫攪拌 4 小時。依序將 20 毫升乙酸乙酯和 20 毫升 1N 鹽酸水溶液加至其中。分離有機層，並將水層以 20 毫升乙酸乙酯萃取，共兩次。合併有機層，依序以 20 毫升 1N 鹽酸水溶液、20 毫升飽和碳酸氫鈉水溶液以及 20 毫升飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，接著於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 0.12 公克下式所示之 5,5,6,6,6-五氟-2-(2-乙硫基乙磺基)-2-甲基己腈(後文中，稱為本發明化合物(7))。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 1.32 (3H, t), 1.80 (3H, s), 2.15-2.55 (4H, m), 2.64 (2H, q), 3.02-3.11 (2H, m), 3.44-3.61 (2H, m)

本發明化合物之具體實例係顯示如下。

一種式(I α)所示之化合物：



[分支編號：A、X、R¹、R⁵、n]=

[2: CF₃CF₂CF₂CH₂, O, H, Me, O];

[4: CF₃CH₂CH₂CH₂, O, H, Me, O];

[6: CF₃CF₂CH₂CH₂CH₂, O, H, Me, O];

[8: CF₂HCF₂CF₂CF₂CH₂, O, H, Me, 0];

[10: CBrF₂CF₂CH₂CH₂, O, H, Me, O];

[11: CF₃CH(Me)CH₂, O, H, Me, O];

[12: CF₃CH(Me)CH₂CH₂, O, H, Me, 0];

[13: CF₃CF₂CH(Me)CH₂CH₂, O, H, Me, O];

[14: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 0];

[15: CF₃CH(Pr)CH₂CH₂, O, H, Me, 0];

[16: CF₃CH(iPr)CH₂CH₂, O, H, Me, O];

[17: CF₃CH(tBu)CH₂CH₂, O, H, Me, 0];

- [18: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{OMe})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 0];
[19: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{SMe})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 0];
[20: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[21: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[22: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[23: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[24: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[25: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[26: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[27: $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[28: $\text{CClF}_2\text{CClFCH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[29: $\text{CBrF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[30: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[31: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[32: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[33: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[34: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Pr})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[35: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{iPr})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[36: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{tBu})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[37: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{OMe})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[38: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{SMe})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 1];
[39: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];
[40: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];
[41: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];
[42: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];

- [43: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];
[44: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];
[45: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];
[46: $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];
[47: $\text{CClF}_2\text{CClFCH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];
[48: $\text{CBrF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];
[49: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];
[50: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];
[51: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];
[52: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];
[53: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Pr})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];
[54: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{iPr})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];
[55: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{tBu})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];
[56: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{OMe})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];
[57: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{SMe})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Me, 2];
[58: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];
[59: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];
[60: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];
[61: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];
[62: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];
[63: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];
[64: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];
[65: $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];
[66: $\text{CClF}_2\text{CClFCH}_2\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];
[67: $\text{CBrF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];

- [68: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];
- [69: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];
- [70: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];
- [71: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];
- [72: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Pr})\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];
- [73: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{iPr})\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];
- [74: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{tBu})\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];
- [75: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{OMe})\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];
- [76: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{SMe})\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Me, 2];
- [77: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];
- [78: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];
- [79: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];
- [80: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];
- [81: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];
- [82: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];
- [83: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];
- [84: $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];
- [85: $\text{CClF}_2\text{CClFCH}_2\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];
- [86: $\text{CBrF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];
- [87: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];
- [88: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];
- [89: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];
- [90: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];
- [91: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Pr})\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];
- [92: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{iPr})\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];

- [93: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{tBu})\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];
[94: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{OMe})\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];
[95: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{SMe})\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO, H, Me, 2];
[96: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[97: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[98: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[99: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[100: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[101: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[102: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[103: $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[104: $\text{CClF}_2\text{CClFCH}_2\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[105: $\text{CBrF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[106: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[107: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[108: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[109: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[110: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Pr})\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[111: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{iPr})\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[112: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{tBu})\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[113: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{OMe})\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[114: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{SMe})\text{CH}_2\text{CH}_2$, SO₂, H, Me, 2];
[115: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];
[116: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];
[117: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];

- [118: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];
- [119: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];
- [120: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];
- [121: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];
- [122: $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];
- [123: $\text{CClF}_2\text{CClFCH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];
- [124: $\text{CBrF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];
- [125: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];
- [126: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];
- [127: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];
- [128: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];
- [129: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Pr})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];
- [130: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{iPr})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];
- [131: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{tBu})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];
- [132: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{OMe})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];
- [133: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{SMe})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Me, 2];
- [134: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];
- [135: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];
- [136: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];
- [137: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];
- [138: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];
- [139: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];
- [140: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];
- [141: $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];
- [142: $\text{CClF}_2\text{CClFCH}_2\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];

- [143: $\text{CBrF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];
- [144: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];
- [145: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];
- [146: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];
- [147: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];
- [148: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Pr})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];
- [149: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{iPr})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];
- [150: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{tBu})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];
- [151: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{OMe})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];
- [152: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{SMe})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Me, 2];
- [153: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];
- [154: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];
- [155: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];
- [156: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];
- [157: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];
- [158: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];
- [159: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];
- [160: $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];
- [161: $\text{CClF}_2\text{CClFCH}_2\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];
- [162: $\text{CBrF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];
- [163: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];
- [164: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];
- [165: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];
- [166: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];
- [167: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{Pr})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];

- [168: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{iPr})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];
[169: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{tBu})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];
[170: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{OMe})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];
[171: $\text{CF}_3\text{CH}(\text{SMe})\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Cl, Me, 2];
[172: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Br, Me, 2];
[173: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, Br, Me, 2];
[174: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Br, Me, 2];
[175: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Br, Me, 2];
[176: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Br, Me, 2];
[177: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Br, Me, 2];
[178: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2$, Me, 2];
[179: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2$, Me, 2];
[180: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2$, Me, 2];
[181: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2$, Me, 2];
[182: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2$, Me, 2];
[183: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2$, Me, 2];
[184: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Me, Me, 2];
[185: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, Me, Me, 2];
[186: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Me, Me, 2];
[187: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Me, Me, 2];
[188: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Me, Me, 2];
[189: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Me, Me, 2];
[190: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, F, Me, 2];
[191: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, F, Me, 2];
[192: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, F, Me, 2];

- [193: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, F, Me, 2];
[194: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, F, Me, 2];
[195: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, F, Me, 2];
[196: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, Me, 2];
[197: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, Cl, Me, 2];
[198: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, Me, 2];
[199: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, Me, 2];
[200: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, Me, 2];
[201: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, Me, 2];
[202: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Br, Me, 2];
[203: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, Br, Me, 2];
[204: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Br, Me, 2];
[205: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Br, Me, 2];
[206: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Br, Me, 2];
[207: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Br, Me, 2];
[208: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2$, Me, 2];
[209: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2$, Me, 2];
[210: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2$, Me, 2];
[211: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2$, Me, 2];
[212: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2$, Me, 2];
[213: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2$, Me, 2];
[214: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, H, 2];
[215: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, H, H, 2];
[216: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, H, 2];
[217: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, H, 2];

- [218: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, H, 2];
- [219: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, H, 2];
- [220: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Et, 2];
- [221: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, H, Et, 2];
- [222: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Et, 2];
- [223: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Et, 2];
- [224: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Et, 2];
- [225: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, Et, 2];
- [226: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, iPr, 2];
- [227: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, H, iPr, 2];
- [228: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, iPr, 2];
- [229: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, iPr, 2];
- [230: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, iPr, 2];
- [231: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, iPr, 2];
- [232: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_3 , 2];
- [233: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_3 , 2];
- [234: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_3 , 2];
- [235: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_3 , 2];
- [236: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_3 , 2];
- [237: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_3 , 2];
- [238: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_2H , 2];
- [239: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_2H , 2];
- [240: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_2H , 2];
- [241: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_2H , 2];
- [242: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_2H , 2];

- [243: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_2H , 2];
- [244: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CFH_2 , 2];
- [245: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, H, CFH_2 , 2];
- [246: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CFH_2 , 2];
- [247: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CFH_2 , 2];
- [248: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CFH_2 , 2];
- [249: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CFH_2 , 2];
- [250: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_3CF_2 , 2];
- [251: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_3CF_2 , 2];
- [252: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_3CF_2 , 2];
- [253: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_3CF_2 , 2];
- [254: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_3CF_2 , 2];
- [255: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_3CF_2 , 2];
- [256: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_3CH_2 , 2];
- [257: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_3CH_2 , 2];
- [258: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_3CH_2 , 2];
- [259: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_3CH_2 , 2];
- [260: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_3CH_2 , 2];
- [261: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_3CH_2 , 2];
- [262: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_2Cl , 2];
- [263: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_2Cl , 2];
- [264: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_2Cl , 2];
- [265: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_2Cl , 2];
- [266: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_2Cl , 2];
- [267: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_2Cl , 2];

- [268: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_2Br , 2];
- [269: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_2Br , 2];
- [270: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_2Br , 2];
- [271: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_2Br , 2];
- [272: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_2Br , 2];
- [273: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, H, CF_2Br , 2];
- [274: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, H, 2];
- [275: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, H, H, 2];
- [276: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, H, 2];
- [277: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, H, 2];
- [278: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, H, 2];
- [279: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, H, 2];
- [280: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Et, 2];
- [281: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, H, Et, 2];
- [282: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Et, 2];
- [283: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Et, 2];
- [284: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Et, 2];
- [285: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, Et, 2];
- [286: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, iPr, 2];
- [287: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, H, iPr, 2];
- [288: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, iPr, 2];
- [289: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, iPr, 2];
- [290: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, iPr, 2];
- [291: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, iPr, 2];
- [292: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_3 , 2];

- [293: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_3 , 2];
[294: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_3 , 2];
[295: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_3 , 2];
[296: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_3 , 2];
[297: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_3 , 2];
[298: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_2H , 2];
[299: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_2H , 2];
[300: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_2H , 2];
[301: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_2H , 2];
[302: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_2H , 2];
[303: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_2H , 2];
[304: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CFH_2 , 2];
[305: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, H, CFH_2 , 2];
[306: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CFH_2 , 2];
[307: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CFH_2 , 2];
[308: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CFH_2 , 2];
[309: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CFH_2 , 2];
[310: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_3CF_2 , 2];
[311: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_3CF_2 , 2];
[312: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_3CF_2 , 2];
[313: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_3CF_2 , 2];
[314: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_3CF_2 , 2];
[315: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_3CF_2 , 2];
[316: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_3CH_2 , 2];
[317: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_3CH_2 , 2];

- [318: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_3CH_2 , 2];
- [319: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_3CH_2 , 2];
- [320: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_3CH_2 , 2];
- [321: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_3CH_2 , 2];
- [322: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_2Cl , 2];
- [323: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_2Cl , 2];
- [324: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_2Cl , 2];
- [325: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_2Cl , 2];
- [326: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_2Cl , 2];
- [327: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_2Cl , 2];
- [328: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_2Br , 2];
- [329: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_2Br , 2];
- [330: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_2Br , 2];
- [331: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_2Br , 2];
- [332: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_2Br , 2];
- [333: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, H, CF_2Br , 2];
- [334: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, H, 2];
- [335: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, Me, H, 2];
- [336: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, H, 2];
- [337: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, H, 2];
- [338: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, H, 2];
- [339: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, H, 2];
- [340: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Et, 2];
- [341: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, Me, Et, 2];
- [342: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Et, 2];

- [343: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Et, 2];
[344: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Et, 2];
[345: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, Et, 2];
[346: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, iPr, 2];
[347: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, Me, iPr, 2];
[348: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, iPr, 2];
[349: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, iPr, 2];
[350: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, iPr, 2];
[351: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, iPr, 2];
[352: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_3 , 2];
[353: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_3 , 2];
[354: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_3 , 2];
[355: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_3 , 2];
[356: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_3 , 2];
[357: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_3 , 2];
[358: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_2H , 2];
[359: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_2H , 2];
[360: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_2H , 2];
[361: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_2H , 2];
[362: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_2H , 2];
[363: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_2H , 2];
[364: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CFH_2 , 2];
[365: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, Me, CFH_2 , 2];
[366: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CFH_2 , 2];
[367: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CFH_2 , 2];

- [368: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CFH_2 , 2];
- [369: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CFH_2 , 2];
- [370: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_3CF_2 , 2];
- [371: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_3CF_2 , 2];
- [372: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_3CF_2 , 2];
- [373: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_3CF_2 , 2];
- [374: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_3CF_2 , 2];
- [375: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_3CF_2 , 2];
- [376: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_3CH_2 , 2];
- [377: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_3CH_2 , 2];
- [378: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_3CH_2 , 2];
- [379: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_3CH_2 , 2];
- [380: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_3CH_2 , 2];
- [381: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_3CH_2 , 2];
- [382: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_2Cl , 2];
- [383: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_2Cl , 2];
- [384: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_2Cl , 2];
- [385: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_2Cl , 2];
- [386: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_2Cl , 2];
- [387: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_2Cl , 2];
- [388: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_2Br , 2];
- [389: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_2Br , 2];
- [390: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_2Br , 2];
- [391: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_2Br , 2];
- [392: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_2Br , 2];

- [393: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, Me, CF_2Br , 2];
- [394: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, H, 2];
- [395: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, F, H, 2];
- [396: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, H, 2];
- [397: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, H, 2];
- [398: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, H, 2];
- [399: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, H, 2];
- [400: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Et, 2];
- [401: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, F, Et, 2];
- [402: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Et, 2];
- [403: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Et, 2];
- [404: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Et, 2];
- [405: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, Et, 2];
- [406: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, iPr, 2];
- [407: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, F, iPr, 2];
- [408: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, iPr, 2];
- [409: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, iPr, 2];
- [410: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, iPr, 2];
- [411: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, iPr, 2];
- [412: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_3 , 2];
- [413: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_3 , 2];
- [414: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_3 , 2];
- [415: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_3 , 2];
- [416: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_3 , 2];
- [417: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_3 , 2];

- [418: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_2H , 2];
- [419: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_2H , 2];
- [420: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_2H , 2];
- [421: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_2H , 2];
- [422: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_2H , 2];
- [423: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_2H , 2];
- [424: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CFH_2 , 2];
- [425: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, F, CFH_2 , 2];
- [426: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CFH_2 , 2];
- [427: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CFH_2 , 2];
- [428: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CFH_2 , 2];
- [429: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CFH_2 , 2];
- [430: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_3CF_2 , 2];
- [431: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_3CF_2 , 2];
- [432: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_3CF_2 , 2];
- [433: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_3CF_2 , 2];
- [434: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_3CF_2 , 2];
- [435: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_3CF_2 , 2];
- [436: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_3CH_2 , 2];
- [437: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_3CH_2 , 2];
- [438: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_3CH_2 , 2];
- [439: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_3CH_2 , 2];
- [440: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_3CH_2 , 2];
- [441: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_3CH_2 , 2];
- [442: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_2Cl , 2];

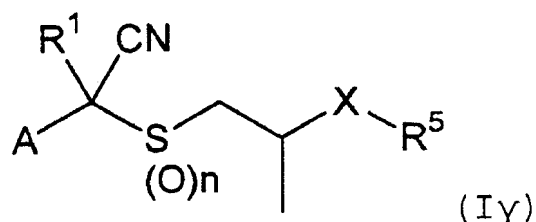
- [443: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_2Cl , 2];
[444: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_2Cl , 2];
[445: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_2Cl , 2];
[446: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_2Cl , 2];
[447: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_2Cl , 2];
[448: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_2Br , 2];
[449: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_2Br , 2];
[450: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_2Br , 2];
[451: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_2Br , 2];
[452: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_2Br , 2];
[453: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, O, F, CF_2Br , 2];
[454: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, H, 2];
[455: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, Cl, H, 2];
[456: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, H, 2];
[457: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, H, 2];
[458: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, H, 2];
[459: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, H, 2];
[460: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, Et, 2];
[461: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, Cl, Et, 2];
[462: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, Et, 2];
[463: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, Et, 2];
[464: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, Et, 2];
[465: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, Et, 2];
[466: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, iPr, 2];
[467: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, Cl, iPr, 2];

- [468: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, iPr, 2];
[469: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, iPr, 2];
[470: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, iPr, 2];
[471: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, iPr, 2];
[472: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CF_3 , 2];
[473: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CF_3 , 2];
[474: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CF_3 , 2];
[475: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CF_3 , 2];
[476: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CF_3 , 2];
[477: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CF_3 , 2];
[478: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CF_2H , 2];
[479: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CF_2H , 2];
[480: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CF_2H , 2];
[481: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CF_2H , 2];
[482: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CF_2H , 2];
[483: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CF_2H , 2];
[484: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CFH_2 , 2];
[485: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CFH_2 , 2];
[486: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CFH_2 , 2];
[487: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CFH_2 , 2];
[488: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CFH_2 , 2];
[489: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CFH_2 , 2];
[490: $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CF_3CF_2 , 2];
[491: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CF_3CF_2 , 2];
[492: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CF_3CF_2 , 2];

[513: $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, S, Cl, CF_2Br , 2].

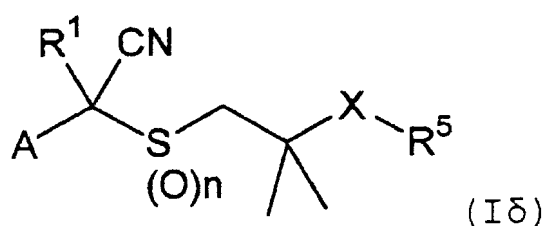
式中，A、X、R¹、R⁵以及n表示上文所示之任一組合。

一種式(I γ)所示之化合物：



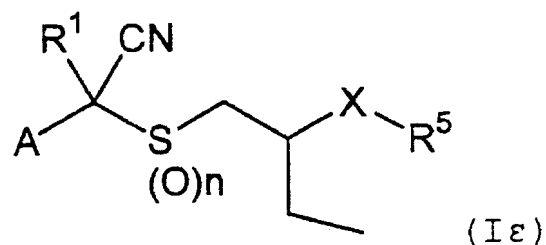
式中，A、X、R¹、R⁵以及n表示上文所示之任一組合。

一種式(I δ)所示之化合物：



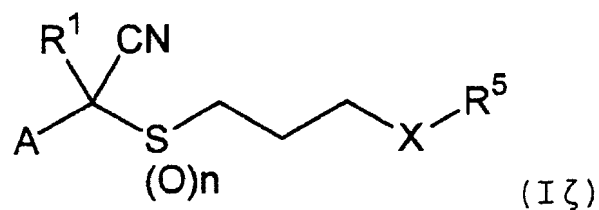
式中，A、X、R¹、R⁵以及n表示上文所示之任一組合。

一種式(I ϵ)所示之化合物：



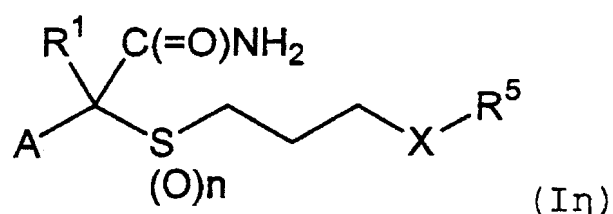
式中，A、X、R¹、R⁵以及n表示上文所示之任一組合。

一種式(I ζ)所示之化合物：



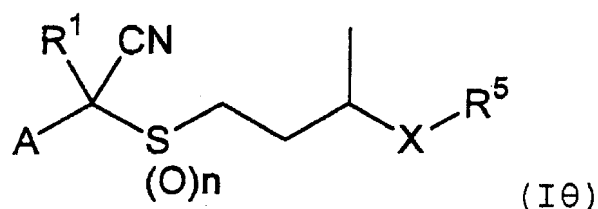
式中，A、X、R¹、R⁵以及n表示上文所示之任一組合。

一種式(I η)所示之化合物：



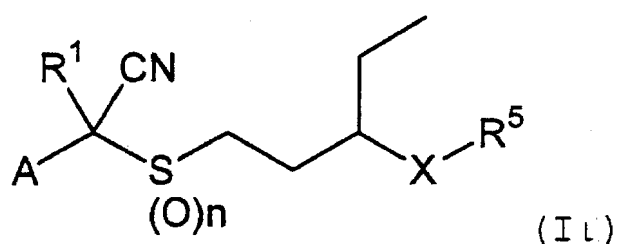
式中，A、X、R¹、R⁵以及n表示上文所示之任一組合。

一種式(Iθ)所示之化合物：



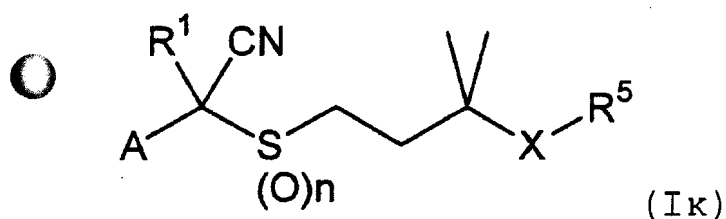
○ 式中，A、X、R¹、R⁵以及n表示上文所示之任一組合。

一種式(Iι)所示之化合物：



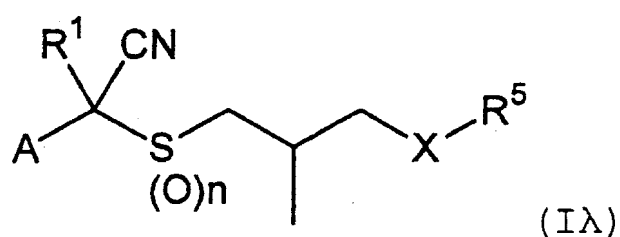
式中，A、X、R¹、R⁵以及n表示上文所示之任一組合。

一種式(Iκ)所示之化合物：



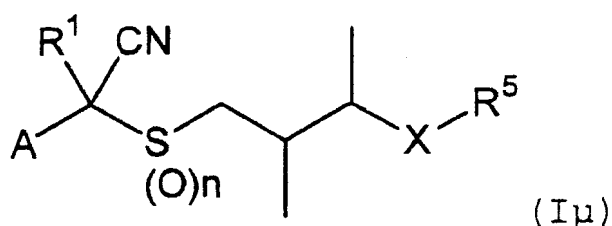
式中，A、X、R¹、R⁵以及n表示上文所示之任一組合。

一種式(Iλ)所示之化合物：



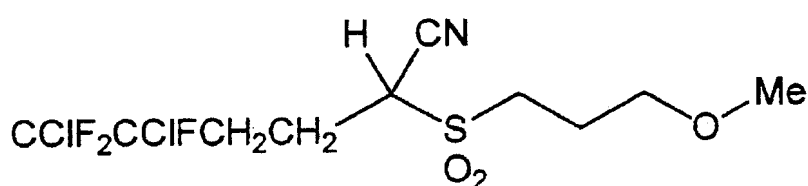
式中，A、X、R¹、R⁵以及n表示上文所示之任一組合。

一種式(I μ)所示之化合物：



式中，A、X、R¹、R⁵以及 n 表示上文所示之任一種組合。

例如，本發明化合物(I ζ -47)為具有下列結構之化合物：



調配例將顯示於下文。術語「份」表示重量份。

調配例 1

將 9 份本發明化合物(1)至(7)中之任一者溶解於 37.5 份二甲苯和 37.5 份 N,N-二甲基甲醯胺中。將 10 份聚氧伸乙基苯乙烯基苯基醚和 6 份十二基苯磺酸鈣加至其中，並且充分攪拌混合，獲得乳化濃縮物。

調配例 2

將 5 份 SORPOL 5060 (TOHO Chemical Industry Co., LTD. 之註冊商標)加至 40 份本發明化合物(1)至(7)中之任一者中，並且充分混合。使用果汁機將該混合物與 32 份 CARPLEX #80 (Shionogi & Co., LTD. 之註冊商標，為合成性水合氧化矽細粉)和 23 份 300 網目(mesh)之矽藻土混合，獲得可溼性粉劑。

調配例 3

將 3 份本發明化合物(1)至(7)中之任一者、5 份合成性水合氧化矽細粉、5 份十二基苯磺酸鈉、30 份膨潤土以及 57 份黏土充分攪拌混合。將適量的水加至此混合物中。進一步攪拌該混合物，以造粒機進行粒化，接著風乾，獲得粒劑。

調配例 4

將 4.5 份本發明化合物(1)至(7)中之任一者、1 份合成性水合氧化矽細粉、1 份作為絮凝劑之 Dorires B(由 Sankyo 製造)以及 7 份黏土置於研鉢中充分混合，隨後再使用果汁機攪拌混合。在所得混合物中加入 86.5 份經切割之黏土，並且充分攪拌混合，獲得粉劑。

調配例 5

將 10 份本發明化合物(1)至(7)中之任一者、35 份聚氧伸乙基烷基醚硫酸銨鹽和白碳之混合物(重量比為 1:1)以及 55 份水混合，然後採用濕式研磨法進行細碎粒化，獲得調配物。

調配例 6

將 0.5 份本發明化合物(1)至(7)中之任一者溶解於 10 份二氯甲烷中。使此溶液與 89.5 份 Isopar M(異烷烴(isoparaffin)，為 Exxon Chemical 的註冊商標)混合，獲得油性溶液。

調配例 7

將 0.1 份本發明化合物(1)至(7)中之任一者和 49.9 份 NEO-THIOZOL(Chuo Kasei Co., Ltd.)放置於氣霧罐中。在

罐上加裝安裝氣霧閥門。於罐中填充 25 份二甲醚和 25 份 LPG。在罐上加裝致動器，獲得油性氣霧劑。

調配例 8

將 0.6 份本發明化合物(1)至(7)中之任一者、0.01 份 BHT、5 份二甲苯、3.39 份脫臭煤油以及 1 份乳化劑[Atmos 300(Atmos Chemical Ltd.之註冊商標)]混合而獲得溶液。將所得溶液及 50 份蒸餾水填充至氣霧劑容器中。在容器上安裝閥門零件，然後在加壓下透過該閥門將 40 份推進劑(1PG)填充至容器中，獲得水性氣霧劑。

下列試驗例證實本發明化合物可有效作為節肢動物害蟲防治組成物之活性成分。

試驗例 1

取根據調配例 5 所獲得之本發明化合物(4)、(5)以及(6)中之任一者的調配物，以水稀釋，以製備具有 55.6 ppm 活性成分之試驗溶液。

另外，將 50 公克培養土 Bonsol No.2(由住友化學股份有限公司(Sumitomo Chemical Co., ltd.)製造)放入聚乙烯杯(其在底部具有 5 個直徑為 5 毫米(mm)之孔洞)中，並於其內播種 10 至 15 粒稻米種子。在稻米植株生長至發育出第二營養葉後，使植物從杯底吸收 45 毫升試驗溶液而進行處理。將該稻米植株置於 25°C 溫室中 6 天，然後再剪成 5 公分相同高度。將 30 隻褐飛蟲(*Nilaparvata lugens*)之第一齡幼蟲釋入杯中，然後將杯子置於在 25°C 溫室中 6 天。然後，檢視寄生在該稻米植株上之褐飛蟲的數量。

結果，經本發明化合物(4)、(5)以及(6)中之任一者處理之植株，寄生害蟲的數量為3隻或更少。

試驗例 2

取根據調配例 5 所獲得之本發明化合物(3)、(4)以及(5)中之任一者的調配物，以水稀釋，以製備具有 500 ppm 活性成分之試驗溶液。

在直徑 5.5 公分之聚乙烯杯的杯底鋪設直徑 5.5 公分的濾紙，再滴加 0.7 毫升試驗溶液於該濾紙。將 30 毫克蔗糖作為誘餌均勻地放置在該濾紙上。將 10 隻普通家蠅 (*Musca domestica*) 之雌性成蟲釋放到該聚乙烯杯內並以蓋子密封。24 小時後，檢視該普通家蠅之存活或死亡數量，並計算害蟲之死亡率。

結果，經本發明化合物(3)、(4)以及(5)中之任一者處理後所顯示的害蟲死亡率為 70% 或更高。

試驗例 3

取根據調配例 5 所獲得之本發明化合物(3)和(4)中之任一者的調配物，以水稀釋，以製備具有 500 ppm 活性成分之試驗溶液。

在直徑 5.5 cm 之聚乙烯杯的杯底鋪設直徑 5.5 cm 的濾紙，再滴加 0.7 毫升試驗溶液於該濾紙。將 30 毫克蔗糖作為誘餌均勻地放置在該濾紙上。將 2 隻德國蜚蠊 (*Blattella germanica*) 之雄性成蟲釋放到該聚乙烯杯內，並以蓋子密封。6 天後，檢視該德國蜚蠊之存活或死亡數量，並計算害蟲之死亡率。

結果，經本發明化合物(3)和(4)中之任一者處理後所顯示的害蟲死亡率為 100%。

試驗例 4

取根據調配例 5 所獲得之本發明化合物(3)和(4)中之任一者的調配物，以水稀釋，以製備具有 500 ppm 活性成分之試驗溶液。

將 0.7 毫升試驗溶液加至 100 毫升離子交換水中(活性成分濃度：3.5 ppm)。將 20 隻淡色庫蚊(*Culex pipiens pallens*)之末齡幼蟲釋放到該溶液中。1 天後，檢視該淡色庫蚊之存活或死亡數量，並計算害蟲之死亡率。

結果，經本發明化合物(3)和(4)中之任一者處理後所顯示的害蟲死亡率為 90%或更高。

[產業利用性]

本發明之化合物對節肢動物害蟲具有防治效果，故此化合物適用於作為節肢動物害蟲防治組成物之活性成分。

【圖式簡單說明】

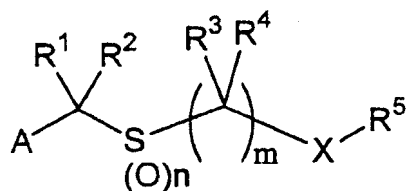
無。

【主要元件符號說明】

無。

三、英文發明摘要：

There is provided a sulfur-containing compound having a controlling effect on arthropod pests represented by the formula (I):



wherein wherein m represents 1, 2 or 3; n represents 0, 1 or 2; A represents an optionally substituted C₂-C₁₀ fluoroalkyl group; R¹ represents an optionally halogenated C₁-C₄ chain hydrocarbon group, a halogen atom, or a hydrogen atom; R² represents an optionally halogenated C₁-C₄ chain hydrocarbon group, etc.; R³ and R⁴ independently represent an optionally halogenated C₁-C₄ chain hydrocarbon group, etc.; X represents an oxygen atom, a sulfur atom, -SO-, or -SO₂-; R⁵ represents an optionally halogenated C₁-C₄ chain hydrocarbon group, etc.

0

$$\begin{array}{c} \text{R}^1 \quad \text{R}^2 \\ \diagdown \quad / \\ \text{A}-\text{C} \\ | \\ \text{S}-(\text{O})_n- \\ | \\ (\text{C})_m-\text{X}-\text{R}^5 \\ / \quad \backslash \\ \text{R}^3 \quad \text{R}^4 \end{array}$$

A 表示視需要經選自群組 E 之基團取代之 C2-C10 氟烷基，

R¹ 表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基、鹵素原子或氫原子，

R² 表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基、-C(=G¹)R⁶、氰基或鹵素原子，

R^3 和 R^4 獨立表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基、視需要經鹵化之苯基、鹵素原子或氫原子，且當 m 表示 2 或 3 時，兩個或更多個 R^3 可彼此相同或相異，以及兩個或更多個 R^4 可彼此相同或相異，

X 表示氧原子、硫原子、 $-SO-$ 或 $-SO_2-$ ，

R⁵ 表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基、-C(=G²)R⁷、氰基或氫原子，

G^1 和 G^2 獨立表示氧原子或硫原子，

R⁶ 表示視需要經鹵化之 C1-C4 烷基、羥基、視需要經鹵化之 C1-C4 烷氧基、視需要經鹵化之 C3-C6 烯氧基、視需要經鹵化之 C3-C6 炔氧基、胺基、視需要經鹵化之 C1-C4 烷基胺基、視需要經鹵化之二(C1-C4 烷基)胺

基、C2-C5 環胺基或氫原子，

R^7 表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基，

群組 E 係由 $-OR^8$ 、 $-SR^8$ 、 $-SO-R^8$ 、 $-SO_2-R^8$ 、氰基、羥基、
氯原子以及溴原子所組成，以及

R^8 表示視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基。

2. 如申請專利範圍第 1 項之含硫化合物，其中， R^2 為 $-C(=G^1)R^6$ 或氰基。
3. 如申請專利範圍第 1 或 2 項之含硫化合物，其中， m 為 2。
4. 如申請專利範圍第 1 或 2 項之含硫化合物，其中， m 為 2，且 R^3 和 R^4 為氫原子。
5. 一種節肢動物害蟲防治組成物，係包括申請專利範圍第 1 至 4 項中任一項之含硫化合物作為活性成分。
6. 一種用於防治節肢動物害蟲之方法，係包括將有效量之申請專利範圍第 1 至 4 項中任一項之含硫化合物施用至節肢動物害蟲或該節肢動物害蟲之棲息地。

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

$$\begin{array}{c} \text{R}^1 \quad \text{R}^2 \\ \diagdown \quad / \\ \text{A}-\text{C} \\ | \\ \text{S}-(\text{O})_n- \\ | \\ (\text{C})(\text{R}^3)(\text{R}^4)_m-\text{X}-\text{R}^5 \end{array}$$

4, 4-五氟丁基、2, 2, 3, 3, 4, 4, 4-七氟丁基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4-八氟丁基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4, 4-九氟丁基、3, 3, 3-三氟-2-甲基丙基以及 2, 3, 3, 3-四氟-2-(三氟甲基)丙基；C5 氟烷基如 2-氟戊基、2, 2-二氟戊基、3-氟戊基、3, 3-二氟戊基、4-氟戊基、4, 4-二氟戊基、5-氟戊基、5, 5-二氟戊基、5, 5, 5-三氟戊基、4, 4, 5, 5, 5-五氟戊基、3, 3, 4, 4, 5, 5, 5-七氟戊基、2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5-八氟戊基、4, 4, 4-三氟-3-甲基丁基以及 2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5, 5-九氟戊基；C6 氟烷基如 2-氟己基、2, 2-二氟己基、3-氟己基、3, 3-二氟己基、4-氟己基、4, 4-二氟己基、5-氟己基、5, 5-二氟己基、6-氟己基、6, 6-二氟己基、6, 6, 6-三氟己基、5, 5, 6, 6, 6-五氟己基、4, 4, 5, 5, 6, 6, 6-七氟己基、3, 3, 4, 4, 5, 5, 6, 6, 6-九氟己基、3-(三氟甲基)戊基以及 2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5, 6, 6, 6-十一氟己基；C7 氟烷基如 3-(三氟甲基)己基和 4-甲基-3-(三氟甲基)戊基；以及 C8 氟烷基如 4, 4-二甲基-3-(三氟甲基)戊基。

群組 E 係由 $-OR^8$ 、 $-SR^8$ 、 $-SO-R^8$ 、 $-SO_2-R^8$ 、氟基、羥基、氯原子以及溴原子所組成。

“ $-OR^8$ ” 所示之基團之實例包含視需要經鹵化之 C1-C4 烷氧基；視需要經鹵化之 C2-C4 烯氧基；視需要經鹵化之 C2-C4 炔氧基如 2-丙炔基氧基和 2-丁炔基氧基；以及視需要經鹵化之 C3-C6 環烷氧基。

“ $-SR^8$ ” 所示之基團之實例包含視需要經鹵化之 C1-C4 烷硫基。

“ $-SO-R^8$ ”所示之基團之實例包含視需要經鹵化之 C1-C4 烷基亞磺基。

“ $-SO_2-R^8$ ”所示之基團之實例包含視需要經鹵化之 C1-C4 烷基磺基。

本文所使用之“視需要經鹵化之 C1-C4 鏈烴基”之實例包含視需要經鹵化之 C1-C4 烷基、視需要經鹵化之 C2-C4 烯基以及視需要經鹵化之 C2-C4 炔基。

本文所使用之“視需要經鹵化之 C1-C4 烷基”之實例包含 C1-C4 烷基如甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基(後文中，可稱為異丙基)、2,2-二甲基丙基以及 1,1-二甲基乙基(後文中，可稱為第三丁基)；以及 C1-C4 鹵烷基如氯甲基、氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、2,2,2-三氯乙基、1,1,2,2-四氯乙基以及 1,1,2,2,2-五氯乙基。

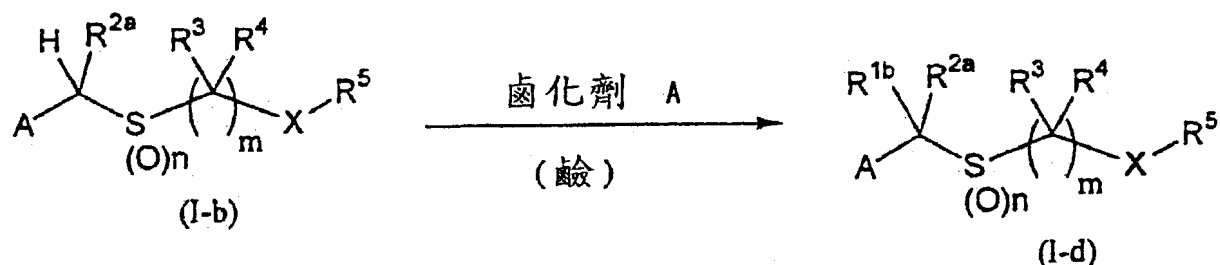
本文所使用之“視需要經鹵化之 C2-C4 烯基”之實例包含 C1-C4 烯基如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-丁烯基以及 2-丁烯基；以及 C1-C4 鹵烯基如 2,2-二氯乙烯基、1,2,2-三氯乙烯基以及 3,3-二氯-2-丙烯基。

本文所使用之“視需要經鹵化之 C2-C4 炔基”之實例包含 C1-C4 炔基如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-甲基-2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基以及 3-丁炔基；以及 C1-C4 鹵炔基如 3,3,3-三氯-1-丙炔基。

本文所使用之“視需要經鹵化之苯基”之實例包含苯基；以及經鹵化之苯基如 4-氯苯基、2-氯苯基以及 4-氯苯

參考製法 1

於式(I)所示之本發明化合物中，化合物(I-d)(式中， R^1 為鹵素原子，且 R^2 為 $-C(=O)R^6$ 或氰基)可藉由下述方法從化合物(I-b)製造：



式中，A、X、 R^{2a} 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、n 以及 m 係如上文所定義，且 R^{1b} 表示鹵素原子。

該反應通常於溶劑之存在下進行。

溶劑之實例包含醯胺類諸如 N,N-二甲基甲醯胺；醚類諸如乙醚和四氫呋喃；有機硫類諸如二甲亞砷和環丁砷；鹵化烴類諸如氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷、二氯甲烷以及二氯苯；脂族腈類諸如乙腈和丙腈；芳香族烴類諸如甲苯和二甲苯；水；以及其混合物。

該反應可於鹼之存在下進行。

鹼之實例包含無機鹼類諸如氫化鈉、氫氧化鈉、氫氧化鉀以及碳酸鉀；鹼金屬烷醇鹽諸如甲醇鈉和第三丁醇鉀；鹼金屬胺化物類(alkali metal amides)諸如二異丙基胺化鋰；以及有機鹼類諸如三乙胺、1,4-二氮雜雙環[2.2.2]辛烷以及 1,8-二氮雜雙環[5.4.0]-7-十一烯。

鹼之用量相對於每 1 莫耳化合物(I-b)，通常係 1 至 10 莫耳。

鹵化劑 A 之實例包含鹵化烴類諸如四氯化碳和六氯乙烷；鹵素諸如氟、氯、溴以及碘；N-鹵化琥珀醯亞胺類諸如 N-氯琥珀醯亞胺、N-溴琥珀醯亞胺以及 N-碘琥珀醯亞胺；N-氟吡啶鎗鹽類諸如 1-氟-2,4,6-三甲基吡啶鎗三氟甲磺酸鹽以及 1,1'-二氟-2,2'-聯吡啶鎗雙四氟硼酸鹽；以及無機鹽類諸如氯化銅(II)和溴化銅(II)。

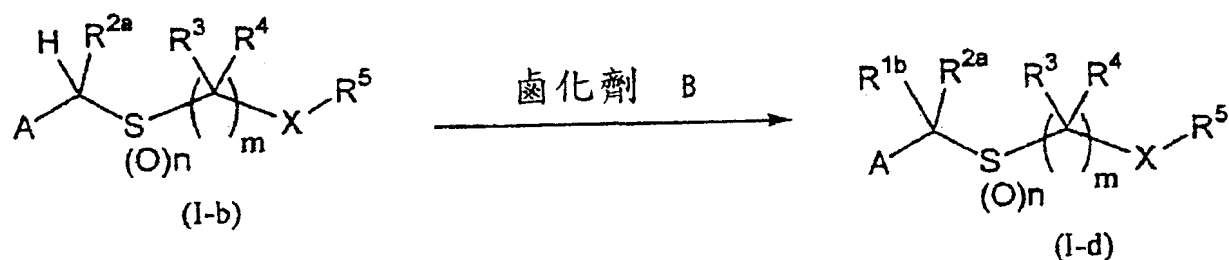
鹵化劑 A 之量相對於每 1 莫耳化合物(I-b)，通常係 1 至 10 莫耳。

反應溫度通常在 -100 至 100°C 之範圍內，且反應時間通常在 1 至 24 小時之範圍內。

反應完成後，可藉由例如將反應混合物倒入水中並以有機溶劑萃取該混合物，接著再進行濃縮，而將化合物(I-d)單離。若有需要，經單離之化合物(I-d)可藉由層析法、再結晶等進一步純化。

參考製法 2

於式(I)所示之本發明化合物中，化合物(I-d)(式中， R^1 為鹵素原子，且 R^2 為 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^5$ 或氰基)可藉由下述方法從化合物(I-b)製造：



式中，A、X、 R^{1b} 、 R^{2a} 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、n 以及 m 係如上文所定義。

(isoprothiolane)、加普胺(carpropamid)、雙氯氰菌胺(diclocymet)、福拉比(furametpyr)、護汰寧(fludioxonil)、撲滅寧(procymidone)及乙黴威(diethofencarb)。

除草劑、植物生長調節劑、增效劑、肥料、土壤調理劑或動物飼料並無限制，可使用傳統已知之除草劑、植物生長調節劑、增效劑、肥料、土壤調理劑或動物飼料。

後文中，本發明係藉由製備例、調配例及試驗例更詳細說明。然而，本發明並不以該等實施例為限。

本文所使用之縮寫具有下列含義。

Me：甲基，Et：乙基，Bn：苯甲基，Ph：苯基，Ts：對甲苯磺醯基以及 Ac：乙醯基。

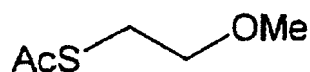
首先，顯示本發明化合物之製備例。

參考製備例 1

[步驟 1-1]

於 0°C 和氮氣氛圍下，以 15 分鐘時間將 7.73 公克 1-氯-2-甲氧基乙烷滴加至 10.28 公克硫乙酸鉀(potassium thioacetate)之 80 毫升(mL)N,N-二甲基甲醯胺懸浮液中，隨後於室溫攪拌 1 小時。將反應混合物加熱至 60°C 後，攪拌 4 小時，接著冷卻至室溫，依序將 100 毫升乙酸乙酯和 100 毫升 1N 鹽酸水溶液加至其中。自混合物分離有機層。水層以 100 毫升乙酸乙酯萃取，共兩次。合併有機層，依序以 30 毫升 1N 鹽酸水溶液、100 毫升飽和碳酸氫鈉水溶液以及 100 毫升飽和鹽水清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過

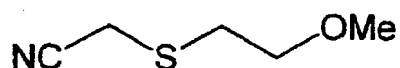
濾，並於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 10.12 公克下式所示之硫乙酸 S-(2-甲氧基乙酯)。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 2.34 (3H, s), 3.09 (2H, t), 3.37 (3H, s), 3.52 (2H, t)

[步驟 1-2]

將 10.12 公克硫乙酸 S-(2-甲氧基乙酯)之 80 毫升四氫呋喃溶液冷卻至 0°C 。以 15 分鐘時間將 15.62 公克含有 28% 甲醇鈉之甲醇溶液滴加至溶液中，隨後於室溫攪拌 1 小時。於 0°C ，將 6.07 公克氯乙腈加至混合物中，隨後於室溫攪拌 4 小時。使反應混合物於冰浴中冷卻，並將 100 毫升飽和氯化鈉水溶液加至其中。接著，混合物以 100 毫升第三丁基甲基醚萃取，共兩次。合併有機層，以飽和氯化鈉水溶液清洗，以硫酸鈉乾燥，進行過濾，隨後於減壓下濃縮。殘留物進行矽膠管柱層析，獲得 4.10 公克下式所示之(2-甲氧基乙硫基)乙腈。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS, δ (ppm)): 2.92 (2H, t), 3.39 (3H, s), 3.43 (2H, s), 3.70 (2H, t)

[步驟 1-3]

於 0°C 和氮氣氛圍下，以 30 分鐘時間將 4.10 公克(2-甲氧基乙硫基)乙腈之 60 毫升甲醇溶液滴加至 19.16 公克 $2\text{KHSO}_5 \cdot \text{KHSO}_4 \cdot \text{K}_2\text{SO}_4$ 複鹽(Oxone(註冊商標))之 60 毫升水懸浮液中，隨後於室溫攪拌 1 小時。將反應混合物加熱至