



(21)申請案號：103106444

(22)申請日：中華民國 103 (2014) 年 02 月 26 日

(51)Int. Cl.：

C07C233/76 (2006.01)

C07C233/78 (2006.01)

C07D213/61 (2006.01)

C07D213/81 (2006.01)

C07D213/82 (2006.01)

C07D241/24 (2006.01)

A01N37/18 (2006.01)

A01N43/40 (2006.01)

A01N43/60 (2006.01)

A01P5/00 (2006.01)

(30)優先權：2013/02/27

歐洲專利局

13156893.3

(71)申請人：先正達合夥公司 (瑞士) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (CH)

瑞士

(72)發明人：珍關納特 安卓 JEANGUENAT, ANDRE (CH)；洛伊盧兒 奧利薇兒 LOISELEUR,

OLIVIER (FR)；卡薩瑞 傑洛米 耶維斯 CASSAYRE, JEROME YVES (FR)；歐

蘇利文 安東尼 柯尼利爾斯 O'SULLIVAN, ANTHONY CORNELIUS (CH)

(74)代理人：閻啟泰；林景郁

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：24 項 圖式數：0 共 123 頁

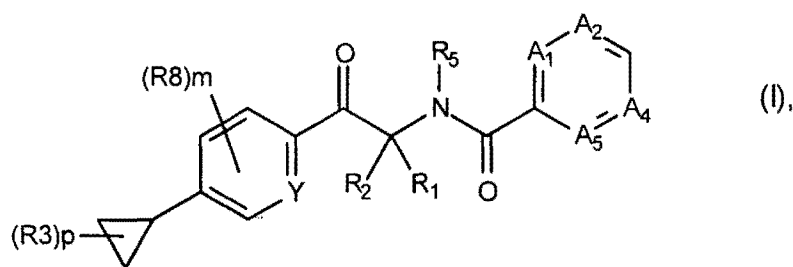
(54)名稱

新穎化合物

NOVEL COMPOUNDS

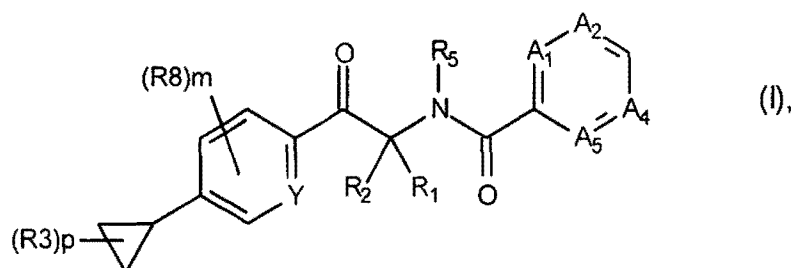
(57)摘要

具有以下式之化合物

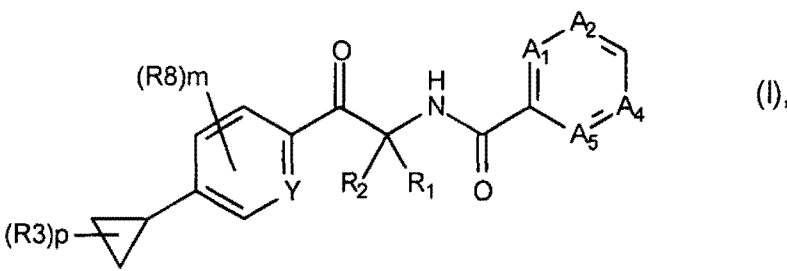


其中該等取代基係如在申請專利範圍第 1 項中所定義，該等化合物適用於作為殺線蟲劑。

Compounds of the formula



in which the substituents are as defined in claim 1, are suitable for use as nematicides.



發明摘要

※ 申請案號： 103106444

※ 申請日：

103. 2. 26

※IPC 分類：

C07C 233/76 (2006.01)
C07C 233/78 (2006.01)
C07D 213/61 (2006.01)
C07D 213/81 (2006.01)
C07D 213/82 (2006.01)
C07D 241/24 (2006.01)
A01N 37/18 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)

【發明名稱】(中文/英文)

新穎化合物

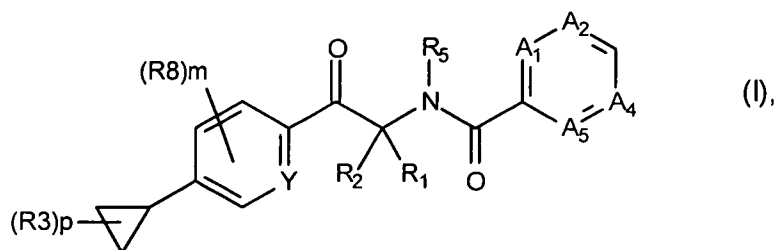
A01N43/60 (2006.01)

A01P5/00 (2006.01)

NOVEL COMPOUNDS

【中文】

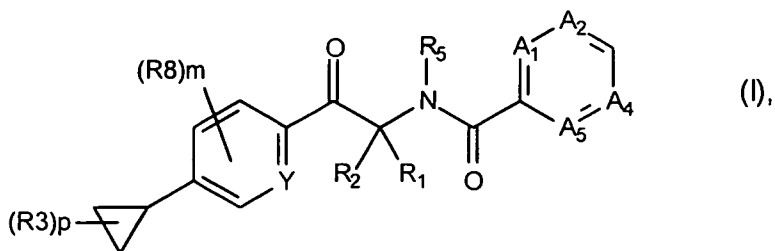
具有以下式之化合物



其中該等取代基係如在申請專利範圍第 1 項中所定義，該等化合物適用於作為殺線蟲劑。

【英文】

Compounds of the formula



in which the substituents are as defined in claim 1, are suitable for use as nematicides.

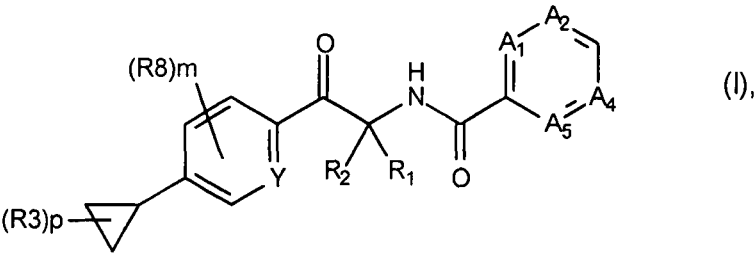
【代表圖】

【本案指定代表圖】：第（ 無 ）圖。

【本代表圖之符號簡單說明】：

無

【本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式】：



發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動)

【發明名稱】(中文/英文)

新穎化合物

NOVEL COMPOUNDS

【技術領域】

本發明涉及新穎的羧醯胺化合物、製備該等化合物的方法以及它們作為殺線蟲劑之用途。

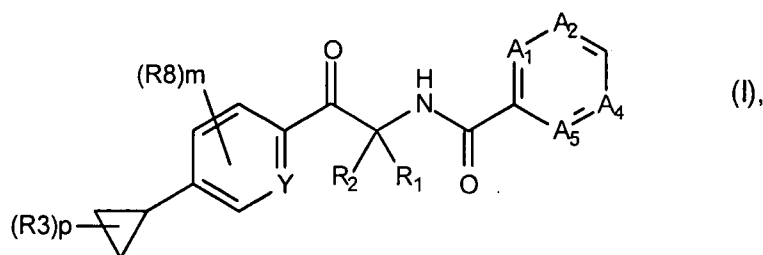
【先前技術】

羧醯胺描述於例如 WO 0160783、WO 03027059 和 WO 06016708 中。

【發明內容】

現在已經發現顯示出良好殺線蟲活性的包含環丙基(雜)芳基部分的新穎羧醯胺。

本發明因此涉及具有式 I 之化合物



其中

Y 係 C-H、C-F、C-Cl 或 N，

A1、A2、A4 和 A5 彼此獨立地是 N、CH 或 CR₆，

其中在包含 A1、A2、A4 和 A5 的環中的 N 原子的數目係 0、1 或 2，

R₆ 彼此獨立地選自鹵素、氰基、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、C1-C4-烷氧基、以及 C1-C4-鹵代烷氧基，

R1 和 R2 各自是甲基，或 R1 和 R2 與其附接至其上的碳原子一起形成環丙基或環丁基環，

R3 彼此獨立地選自鹵素、氰基、R9、O-R9、NO₂、COOR9、CONHR9、CONR9aR9、NHR9、NR9aR9、以及 NHCOR9，

R8 彼此獨立地選自鹵素、氰基、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、C1-C4-烷氧基、以及 C1-C4-鹵代烷氧基，

R9 和 R9a 彼此獨立地選自未取代的或被一個或多個 R10 取代的 C1-C4-烷基、未取代的或被一個或多個 R10 取代的 C2-C6-烯基、未取代的或被一個或多個 R10 取代的 C2-C6-炔基、未取代的或被一個或多個 R10 取代的芳基、或未取代的或被一個或多個 R10 取代的雜芳基，

R10 彼此獨立地選自鹵素、氰基、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、C1-C4-烷氧基、以及 C1-C4-鹵代烷氧基，

p 係 0 至 4，

m 係 0 至 3，

以及該等化合物的互變異構物/同分異構物/非鏡像異構物/鏡像異構物。

在各自的情況下處於游離形式或鹽形式的具有式 (I) 之化合物、以及適當時其互變異構物可以按可能的異構物之一的形式或作為該等的混合物而存在，例如以純異構物的形式，比如鏡像異構物和/或非鏡像異構物，或作為異構物混合物，比如鏡像異構物混合物，例如外消旋物、非鏡像異構物混合物或外消旋物混合物，這取決於存在於分子中的不對稱碳原子的數目、絕對和相對組態，和/或取決於存在於分子中的非芳香族雙鍵的組態；本發明涉及該等純異構物並且還涉及可能的所有異構物混合物並且應該在

以上和以下的每種情況下以此意義進行理解，即使在每種情況下未具體提到立體化學的細節。本發明因此涵蓋了所有的此類異構物以及互變異構物以及它們的處於所有比例的混合物，連同同位素形式，例如氘化的化合物。作為實例，本發明化合物可以包含一個或多個不對稱碳原子，並且該等具有式 (I) 之化合物可以作為鏡像異構物（或非鏡像異構物對）或作為此類的混合物而存在。

本發明還涵蓋每個具有式 (I) 之化合物的鹽和 N-氧化物。

熟習該項技術者還瞭解由於在環境中及在生理條件下化合物的鹽與其相應非鹽形式處於平衡狀態，所以鹽也具有非鹽形式的生物學效用。

因此，本發明化合物（以及與本發明的活性成分組合使用的活性成分）的多種鹽可用於控制無脊椎有害生物以及動物寄生蟲。在農業和/或生理學之中可容許的鹽包括與以下無機酸或有機酸形成的酸加成鹽，諸如氫溴酸、鹽酸、硝酸、磷酸、硫酸、乙酸、丁酸、富馬酸、乳酸、馬來酸、丙二酸、草酸、丙酸、水楊酸、酒石酸、4-甲苯磺酸或戊酸。

在農業和/或生理學上可容許的鹽中適合的也可以是陽離子鹽，它們不對具有式 (I) 之化合物的殺有害生物和/或殺寄生蟲行為產生不利影響。因此，尤其適合的陽離子係鹼金屬包括鈉、鉀與鋰的離子，鹼土金屬包括鈣與鎂的離子，以及過渡金屬包括錳、銅、鐵、鋅、鈷、鉛、銀、鎳的離子；以及還有銨或有機銨包括單烷基銨、二烷基銨、三烷基銨、四烷基銨、單烯基銨、二烯基銨、三烯基銨、單炔基銨、二炔基銨、單鏈烷醇銨、二鏈烷醇銨、C5-C6-環烷基銨、哌啶鎘、咪啉鎘、吡咯啉鎘、或苄基銨、此外有磷離子、銻離子，較佳的是三(C1-C4-烷基)銻以及氧化銻離子，較佳的是

三(C1-C4-烷基)氧化硫。

烷基基團（單獨地或作為更大的基團的一部分，例如烷氧基-、烷基羰基-或烷氧基羰基-）可以處於直鏈或支鏈的形式並且是例如甲基、乙基、1-丙基、丙-2-基、1-丁基、丁-2-基或2-甲基-丙-2-基。在本發明的每個實施方式中，該烷基基團（單獨地或作為更大的基團的一部分，例如烷氧基-、烷基羰基-或烷氧基羰基-）較佳的是 C1-C3-烷基，更佳的是 C1-C2-烷基，尤其是甲基。在烷氧基的情況下，實例係甲氧基、乙氧基、丙氧基、正丁氧基、異丁氧基以及它們的同分異構基；較佳的是，獨立於其他實施方式，甲氧基和乙氧基，尤其是甲氧基。

烯基基團可以處於直鏈或支鏈的形式，並且可以是（適當時）具有(E)-或(Z)-的組態。實例係乙烯基和烯丙基。在本發明的每個實施方式中，該烯基較佳的是 C2-C3 烯基，更佳的是乙烯基或烯丙基。

炔基基團可以處於直鏈或支鏈的形式。實例係乙炔基和炔丙基。在本發明的每個實施方式中，該炔基較佳的是 C2-C3-炔基，更佳的是炔丙基。

鹵素係氟、氯、溴或碘；在本發明的每個實施中，鹵素係氟、氯、或溴；尤其是氟、氯或溴。

鹵代烷基基團（單獨地或作為更大基團的一部分，例如鹵代烷氧基-）係由一個或多個相同或不同的鹵素原子取代的烷基基團並且是例如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯二氟甲基以及 2,2,2-三氟乙基。在本發明的每個實施方式中，該鹵代烷基基團（單獨地或作為更大的基團的一部分，例如鹵代烷氧基-）較佳的是三氟甲基和二氟甲基。在鹵代烷氧基的例子中，實例係氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2,2-三氟乙氧基、1,1,2,2-四氟乙氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2,2-二氟乙氧基和 2,2,2-三氯乙氧基；較佳的是二氟甲氧基、2,2,2-三氯乙氧基、2-氯乙氧基和三氟甲氧基。

環烷基基團係單環的，並且是例如環丙基、環丁基、環戊基和環己基。在本發明的每個實施方式中，該 C3-C6-環烷基較佳的是 C3-C5 環烷基，更佳的是 C3-C4-環烷基，尤其是 C3-環烷基。當環烷基部分被認為被取代時，該環烷基部分較佳的是由一至四個取代基取代的，更佳的是由一至三個取代基取代，例如一或兩個取代基取代，尤其被一個取代基取代。

烷氧基羰基係，例如甲氧基羰基、乙氧基羰基、丙氧基羰基、異丙氧基羰基、正丁氧基羰基、異丁氧基羰基、二級丁氧基羰基以及三級丁氧基羰基；較佳的是甲氧基羰基、乙氧基羰基以及異丙氧基羰基。

烷氧基烷基係，例如，甲氧基甲基、2-甲氧基乙基、乙氧基甲基、2-乙氧基乙基、正丙氧基甲基、正丙氧基 2-乙基、異丙氧基甲基以及 1-異丙氧基乙基。在本發明的每個實施方式中，該烷氧基烷基較佳的是 C1-C4-烷氧基-C1-C4-烷基，更佳的是 C1-C2-烷氧基-甲基，如甲氧基甲基以及乙氧基甲基。

芳基基團（單獨地或作為更大基團的一部分，如芳基-伸烷基-）係可以處於單、雙或三環形式的芳香族環系統。此類環的實例包括苯基、萘基、蒽基、茚基或菲基。較佳的芳基基團係苯基和萘基，苯基係最佳的。

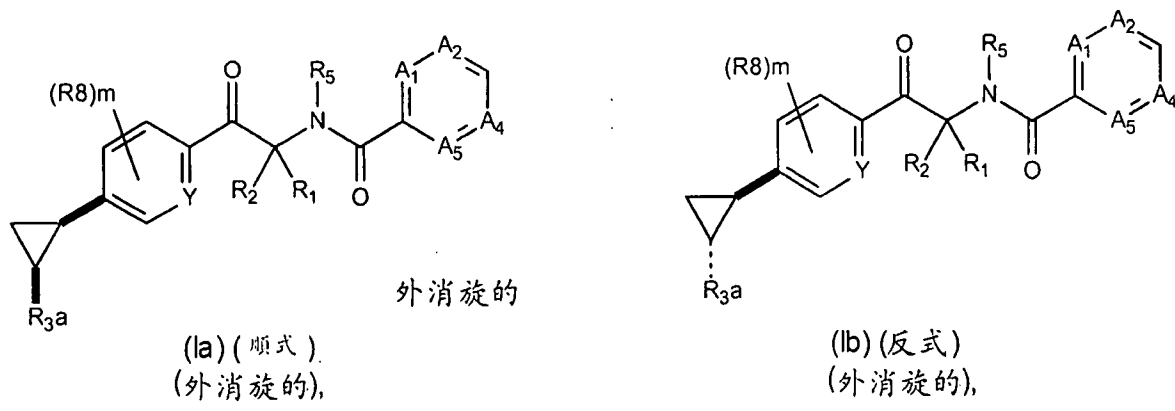
環烷基羰基的實例係環丙基羰基，環丁基羰基，環戊基羰基以及環己基羰基；較佳的是環丙基羰基以及環丁基羰基。

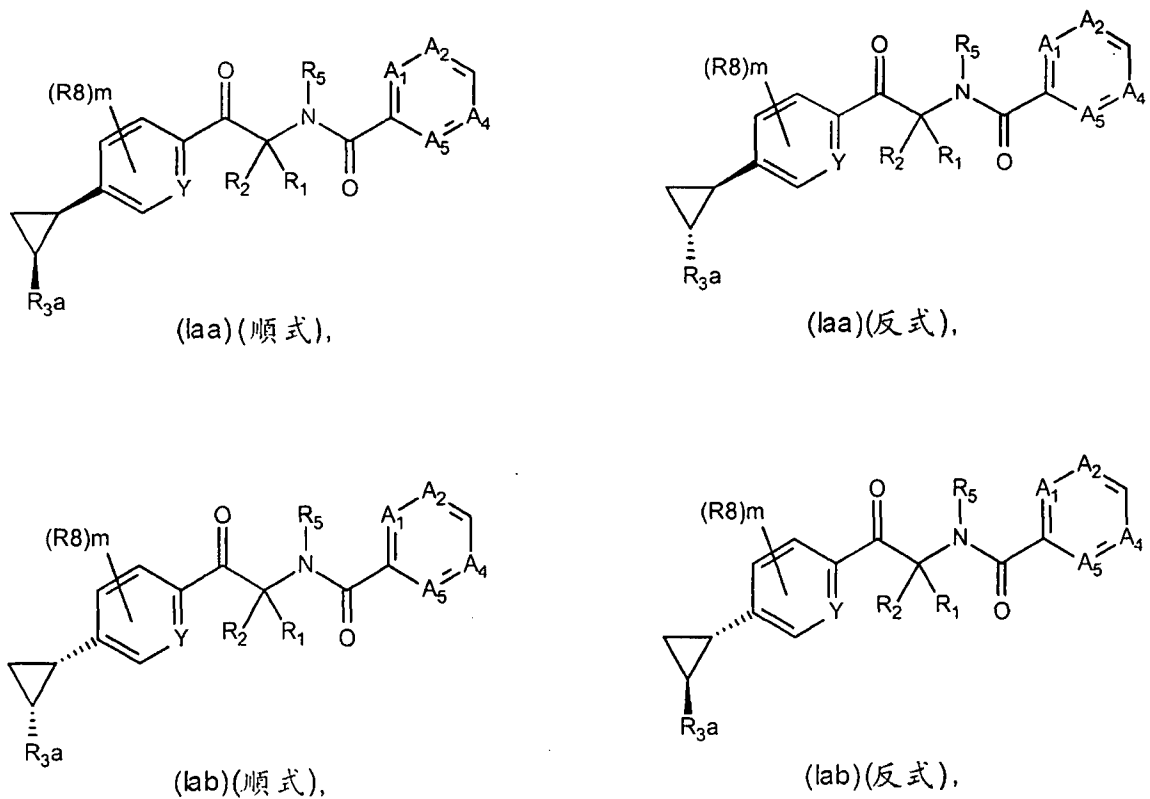
環烷氧基羰基的實例係環丙基氧基羰基、環丁基氧基羰基、環戊基氧基羰基以及環己基氧基羰基；較佳的是環丙基氧基羰基以及環丁基氧基羰基。

術語“雜芳基”指芳環系統，該芳環系統包含至少一個雜原子並且由一個單環或兩個稠和的環組成。較佳的是，單環包含多至 3 個雜原子並且雙環系統包含多至 5 個雜原子，該等雜原子較佳的是選自氮、氧和硫。此類基團的實例包括呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡啶基、咪唑基、1,2,3-三唑

基、1,2,4-三唑基、噁唑基、異噁唑基、噻唑基、異噻唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,5-噁二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,2,5-噻二唑基、吡啶基、嘧啶基、嗒咭基、吡咭基、1,2,3-三咭基、1,2,4-三咭基、1,3,5-三咭基、苯并呋喃基、苯并異呋喃基、苯并噻吩基、苯并異噻吩基、吲哚基、異吲哚基、吲唑基、苯并噻唑基、苯并異噻唑基、苯并噁唑基、苯并異噁唑基、苯并咪唑基、2,1,3-苯并噁二唑、喹啉基、異喹啉基、吡啉基、酞咭基、噻唑咭基、噻噁咭基、噻啉基、苯并三咭基、嘌呤基、喋啶基以及吲哚基。

具有式 I 之化合物能以同分異構形式出現。例如，當存在一個取代基 R3 時，在環丙基環上具有兩個手性中心的順式 (1a) 和反式 (1b) 同分異構形式係可能的。順式 (1a) 和反式 (1b) 外消旋形式係非鏡像異構物並且它們中的每個是兩種鏡像異構物順式 (1aa)/順式 (1ab) 和反式 (1aa)/反式 (1ab) 的混合物。對於鏡像異構形式，兩個手性中心都具有其形式上倒置的絕對立體化學。



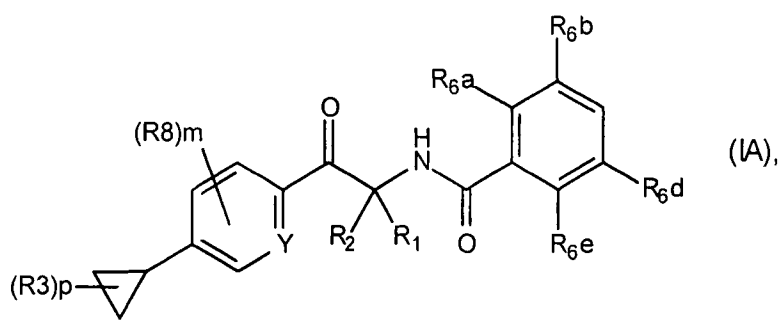


因此，具有式 (I) 之化合物（包括具有式 (IA)、(IB)、(IC) 或 (ID) 的化合物）可以處於具有式 (Ia)（順式）、(Ib)（反式）、(1aa)（順式）、(1ab)（順式）、(1aa)（反式）以及 (1ab)（反式）中的每種的形式。

可能的是具有式 (I) 之化合物在取代基之一中具有另外的立體化學中心。然後可能有另外的同分異構物。本發明涵蓋了所有的此類異構物及其混合物。

具有式 I 的該等化合物能以不同的互變異構的形式存在。本發明涵蓋了所有那些互變異構的形式及其混合物。

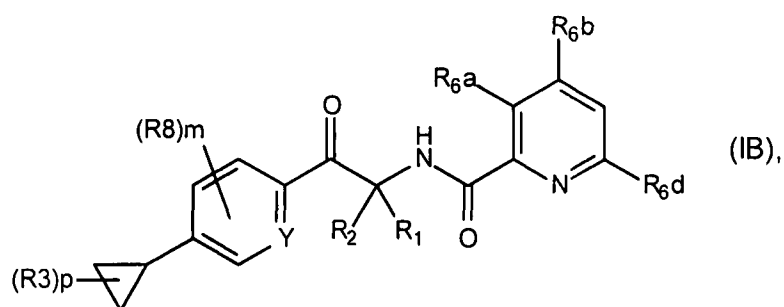
較佳的是具有式 IA 的化合物



其中 R1、R2、R3、R8、Y、m 以及 p 係如以上對於式 (I) 所定義的，並且 R6a、R6b、R6d 和 R6e 獨立地是、獨立地選自氫、鹵素、C1-C4-烷基、以及 C1-C4-鹵代烷基。

在實施方式中，具有式 IA 的化合物係其中 R1、R2、R3、R8、Y、m 以及 p 係如以上對於式 (I) 所定義的，並且 R6a、R6b、R6d 和 R6e 獨立地選自氫、鹵素、C1-C2-烷基、以及 C1-C2-鹵代烷基；較佳的是，獨立地選自氫、二氟甲基、三氟甲基、氰基以及鹵素；尤其是獨立地選自氫、氟和氯。在實施方式中，獨立於 R6b、R6d 和 R6e 上的取代基，R6a 係 C1-C2-烷基、或 C1-C2-鹵代烷基（較佳的是二氟甲基或三氟甲基）、氰基和鹵素，具體地，R6a 係氟或氯。在較佳實施方式中，具有式 IA 的化合物係其中 R6a、R6b、R6d 和 R6e 彼此獨立地選自氫、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、以及鹵素，Y 係 CH 或 N，R1 和 R2 各自是甲基，m 係 0 或 1，在 m 係 1 的事件中，R8 係氯、氟或三氟甲基，R3 獨立地選自鹵素、氰基、C1-C2-烷基、或 C1-C2-鹵代烷基，並且 p 係 0，1 或 2。

較佳的是具有式 IB 的化合物



其中 R1、R2、R3、R8、Y、m 以及 p 係如以上對於式 (I) 所定義的，並且 R6a、R6b、和 R6d 獨立地選自氫、鹵素、C1-C4-烷基、以及 C1-C4-鹵代烷基。

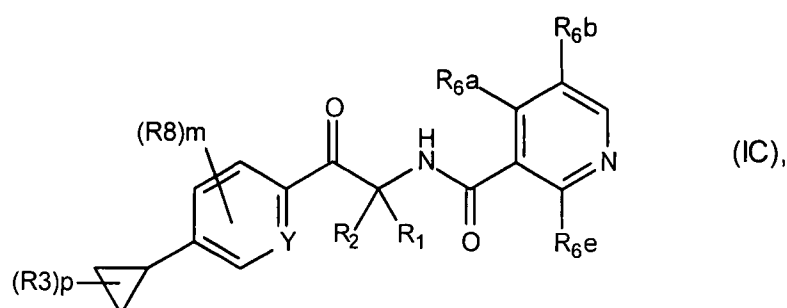
在實施方式中，具有式 IB 的化合物係其中 R1、R2、R3、R8、Y、m 以及 p 係如以上對於式 (I) 所定義的，並且 R6a、R6b、和 R6d 獨立地選自氫、

鹵素、C1-C2-烷基、C1-C2-烷氧基、以及 C1-C2-鹵代烷基；較佳的是，獨立地選自氫、二氟甲基、三氟甲基、氰基以及鹵素；尤其是獨立地選自氫、氟、甲氧基、氯和溴。在實施方式中，獨立於 R6b、和 R6d 上的取代基，R6a 係 C1-C2-烷基、或 C1-C2-鹵代烷基（較佳的是二氟甲基或三氟甲基）、氰基和鹵素，具體地，R6a 係氟、甲氧基、氯或溴。

在較佳實施方式中，具有式 IB 的化合物係其中 R1、R2、R3、R8、Y、m 以及 p 係如以上對於式 (I) 所定義的，並且 R6a、R6b、和 R6d 獨立地選自氫、鹵素、C1-C2-烷基、以及 C1-C2-鹵代烷基；較佳的是，獨立地選自氫、二氟甲基、三氟甲基、氰基以及鹵素；尤其是獨立地選自氫、氟、氯、以及溴。在實施方式中，獨立於 R6b、和 R6d 上的取代基，R6a 係 C1-C2-烷基、或 C1-C2-鹵代烷基（較佳的是二氟甲基或三氟甲基）、氰基和鹵素，具體地，R6a 係氟、氯、或溴。

在更佳實施方式中，具有式 IB 的化合物係其中 R6a、R6b、和 R6d 彼此獨立地選自氫、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、以及鹵素，Y 係 CH 或 N，R1 和 R2 各自是甲基，m 係 0 或 1，在 m 係 1 的事件中，R8 係氯、氟或三氟甲基，R3 獨立地選自鹵素、氰基、C1-C2-烷基、或 C1-C2-鹵代烷基，並且 p 係 0，1 或 2。

較佳的是具有式 IC 的化合物



其中 R1、R2、R3、R8、Y、m 以及 p 係如以上對於式 (I) 所定義的，並且 R6a、R6b、和 R6e 獨立地選自氫、鹵素、C1-C4-烷基、C1-C3-烷氧基

以及 C1-C4-鹵代烷基。

在實施方式中，具有式 IC 的化合物係其中 R1、R2、R3、R8、Y、m 以及 p 係如以上對於式 (I) 所定義的，並且 R6a、R6b、和 R6e 獨立地選自氫、鹵素、C1-C4-烷基、以及 C1-C4-鹵代烷基。

在較佳實施方式中，具有式 IC 的化合物係其中 R1、R2、R3、R8、Y、m 以及 p 係如以上對於式 (I) 所定義的，並且 R6a、R6b、和 R6e 獨立地選自氫、鹵素、C1-C2-烷基、以及 C1-C2-鹵代烷基；較佳的是，獨立地選自氫、二氟甲基、三氟甲基、氰基以及鹵素；尤其是獨立地選自氫、氟、溴、以及氯，更佳的是獨立地選自氫、二氟甲基、三氟甲基、氰基以及鹵素；尤其是獨立地選自氫、氟和氯。在實施方式中，獨立於 R6a、和 R6b 上的取代基，R6e 係 C1-C2-烷基、或 C1-C2-鹵代烷基（較佳的是二氟甲基或三氟甲基）、氰基和鹵素，具體地，R6e 係氯、或溴。在另一個實施方式中，獨立於 R6b、和 R6e 上的取代基，R6a 係 C1-C2-烷基、或 C1-C2-鹵代烷基（較佳的是二氟甲基或三氟甲基）、氰基和鹵素，具體地，R6a 係氟、或氯。

在較佳實施方式中，具有式 IC 的化合物係其中 R6a、R6b、和 R6e 彼此獨立地選自氫、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、以及鹵素，Y 係 CH 或 N，R1 和 R2 各自是甲基，m 係 0 或 1，在 m 係 1 的事件中，R8 係氯、氟或三氟甲基，R3 獨立地選自鹵素、氰基、C1-C2-烷基、或 C1-C2-鹵代烷基，並且 p 係 0，1 或 2。

較佳的是，在具有式 (I) 之實施方式（包括具有式 (IA)、(IB)、和 (IC) 中的每種）中，獨立於其他實施方式，Y 係 CH 或 N；更佳的是，Y 係 CH。

較佳的是，在具有式 (I) 之實施方式（包括具有式 (IA)、(IB)、和 (IC) 中的每種）中，獨立於其他實施方式，R1 和 R2 各自是甲基或與其附接至其上的碳原子一起是環丙基或環丁基環；更佳的是，在具有式 (I) 的實施方式（包括具有式 (IA)、(IB)、和 (IC) 中的每種）中，獨立於其他實施方

式，R1 和 R2 各自是甲基或與其附接至其上的碳原子一起是環丙基環；甚至更佳的是，R1 和 R2 各自是甲基。較佳的是，在具有式 (I) 的實施方式（包括具有式 (IA)、(IB)、和 (IC) 中的每種）中，獨立於其他實施方式，R8 獨立地選自鹵素、氰基、C1-C2-烷基、或 C1-C2-鹵代烷基；更佳的是，R8 獨立地選自氟、氯或三氟甲基。

在這一事件中，m 係 1，R8 較佳的是在羰基的鄰位；並且較佳的是氟。

較佳的是，在具有式 (I) 的實施方式（包括具有式 (IA)、(IB)、和 (IC) 中的每種，以及式 (IIc) 和 (IVa)）中，獨立於其他實施方式，每個 R6（包括 R6a、R6b、R6c、R6d 以及 R6e）獨立地選自氫、鹵素、C1-C2-烷基、C1-C2-烷氧基以及 C1-C2-鹵代烷基；

更佳的是，獨立地選自氫、鹵素、C1-C2-烷基以及 C1-C2-鹵代烷基；甚至更佳的是，獨立地選自氫、二氟甲基、三氟甲基、氰基以及鹵素；尤其是獨立地選自氫、氟、氯以及溴；更尤其是獨立地選自氫、氟以及氯。

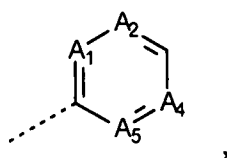
較佳的是，在具有式 (I) 的實施方式（包括具有式 (IA)、(IB)、和 (IC) 中的每種）中，獨立於其他實施方式，R9 和 R9a 較佳的是選自可任選地被一個或多個 R10 取代的 C1-C4-烷基，其中 R10 獨立地選自鹵素、氰基、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、C1-C4-烷氧基、以及 C1-C4-鹵代烷氧基。

較佳的是，在具有式 (I) 的實施方式（包括具有式 (IA)、(IB)、和 (IC) 中的每種）中，獨立於其他實施方式，當 p 係 1、2、3 或 4 時，R3 獨立地選自鹵素、氰基、C1-C2-烷基、C1-C2-鹵代烷基、以及被一個或多個獨立地選自 C1-C4-鹵代烷基、C1-C4-鹵代烷氧基、以及鹵素取代的苯基；較佳的是，R3 獨立的選擇鹵素、氰基、C1-C2-烷基、C1-C2-鹵代烷基；更佳的是，R3 獨立地選自氯、氟和三氟甲基。在 R3 係苯基的例子中，苯基上的一個或多個取代基較佳的是獨立選自氯和氟。在實施方式中，p 係 2、3 或 4 並且每個 R3 都相同。

較佳的是，在具有式 (I) 的實施方式（包括具有式 (IA)、(IB)、和 (IC) 中的每種）中，獨立於其他實施方式，p 係 0、1 或 2；更佳的是 1。

較佳的是，在具有式 (I) 的實施方式（包括具有式 (IA)、(IB)、和 (IC) 中的每種）中，獨立於其他實施方式，m 係 0、1 或 2；更佳的是，m 係 0 或 1，尤其是 m 係 0。

包含 A1、A2、A4 和 A5 的環的較佳實例（參見以下）係



2,6-二氟苯基 (G1)、2-三氟甲基-苯基 (G2)、2-氟苯基 (G3)、3-三氟甲基-2-吡啶基 (G4)、3-氯-2-吡啶基 (G5)、2-三氟甲基-3-吡啶基 (G6)、2-氯-3-吡啶基 (G7)、3-氟-2-吡啶基 (G8)、3-氯-2-吡嗪基 (G9)、3-甲基-2-吡嗪基 (G10)、3-溴-2-吡嗪基 (G11)、3-三氟甲基-2-吡嗪基 (G12)、3-溴-2-吡啶基 (G13)、2-溴-3-吡啶基 (G14)、3-甲基-2-吡啶基 (G15)、3-甲氧基-2-吡啶基 (G16)、2-甲苯基 (G17)、2-氯苯基 (G18)。

較佳的是，該環係 2,6-二氟苯基 (G1)、3-三氟甲基-2-吡啶基 (G4)、3-氯-2-吡啶基 (G5)、2-三氟甲基-3-吡啶基 (G6)、2-氯-3-吡啶基 (G7)、3-氟-2-吡啶基 (G8)、3-氯-2-吡嗪基 (G9)、或 3-溴-2-吡啶基 (G13)；有利地，該環係 2,6-二氟苯基 (G1)、3-三氟甲基-2-吡啶基 (G4)、3-氯-2-吡啶基 (G5)、2-三氟甲基-3-吡啶基 (G6)、2-氯-3-吡啶基 (G7)、3-氟-2-吡啶基 (G8)、或 3-溴-2-吡啶基 (G13)。

在另一組具有式 (I) 之化合物中，包含 A1、A2、A4 和 A5 的環的較佳實例係 2,6-二氟苯基 (G1)、2-三氟甲基-苯基 (G2)、2-氟苯基 (G3)、3-三氟甲基-2-吡啶基 (G4)、3-氯-2-吡啶基 (G5)、2-三氟甲基-3-吡啶基 (G6)、2-氯-3-吡啶基 (G7)、3-氟-2-吡啶基 (G8)、3-氯-2-吡嗪基 (G9)、3-甲基-2-

吡咻基 (G10)、3-溴-2-吡咻基 (G11) 以及 3-三氟甲基-2-吡咻基 (G12)。

較佳的是，在這一組化合物中，該環係 2,6-二氟苯基 (G1)、3-氯-2-吡咻基 (G5)、2-三氟甲基-3-吡咻基 (G6)、2-氯-3-吡咻基 (G7)、3-氟-2-吡咻基 (G8)、3-氯-2-吡咻基 (G9)、3-甲基-2-吡咻基 (G10) 或 3-溴-2-吡咻基 (G11)；有利地，該環係 2,6-二氟苯基 (G1)、3-氯-2-吡咻基 (G5)、2-三氟甲基-3-吡咻基 (G6)、2-氯-3-吡咻基 (G7)、3-氟-2-吡咻基 (G8)、3-氯-2-吡咻基 (G9) 或 3-甲基-2-吡咻基 (G10)。

在一組具有式 (I) 之化合物中，Y 係 CH 或 N，R1 和 R2 各自是甲基或與其附接至其上的碳原子一起是環丙基或環丁基環；p 係 0、1 或 2；在 p 係 1 或 2 的事件中，每個 R3 獨立獨立選自鹵素和 C1-C2-鹵代烷基；m 係 0 或 1；在 m 係 1 的事件中，R8 係鹵素；並且包含 A1、A2、A4 和 A5 的環選自 2,6-二氟苯基 (G1)、3-三氟甲基-2-吡咻基 (G4)、3-氯-2-吡咻基 (G5)、2-三氟甲基-3-吡咻基 (G6)、2-氯-3-吡咻基 (G7)、3-氟-2-吡咻基 (G8)、或 3-溴-2-吡咻基 (G13)。

在另一組具有式 (I) 之化合物中，Y 係 CH 或 N，R1 和 R2 各自是甲基或與其附接至其上的碳原子一起是環丙基環；p 係 0、1 或 2；在 p 係 1 或 2 的事件中，每個 R3 獨立地選自鹵素和 C1-C2-鹵代烷基；m 係 0 或 1；在 m 係 1 的事件中，R8 係鹵素；並且包含 A1、A2、A4 和 A5 的環選自 2,6-二氟苯基 (G1)、3-氯-2-吡咻基 (G5)、2-三氟甲基-3-吡咻基 (G6) 或 2-氯-3-吡咻基 (G7)。

【圖式簡單說明】

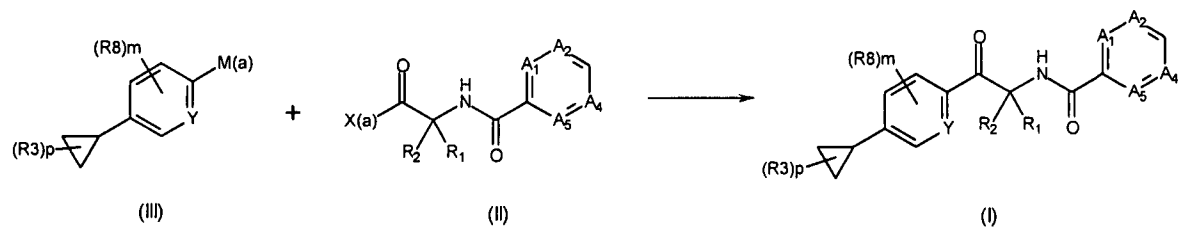
無

【實施方式】

具有式 I 之化合物可以根據方案 1 來製備，藉由具有式 III 的有機金屬化合物（其中 R3、p、R8、m 和 Y 係如在式 I 下所定義的，並且 M(a) 係金

屬，例如鹼金屬（如鋰）或鹼土金屬鹵化物，例如氯化鎂或溴化鎂）與具有式 II 的羧酸衍生物（其中 A1、A2、A4、A5、R1 和 R2 如在式 I 下所定義的，並且 X(a) 係 C1-C6 烷氧基、雜-取代的-C1-C6 烷氧基或雜原子-取代的二烷基胺基，較佳的是 *N,O*-二甲基羥基胺基或咪啉基）的醯化，並且這通常在試劑中，如二氯甲烷、氯仿、甲苯、DMF，但是較佳的是 THF，持續 10 分鐘與 5 小時之間，較佳的是 30 min 至 2 小時，並且在 -80°C 至 25°C 之間，較佳的是 -80°C 至 0°C。從文獻中已知這樣類型的偶合反應的許多實例，例如從 Tetrahedron Letters (《四面體快報》)，1981, 22, 3815 或從 Synlett (《合成有機化學快報》)，1997, 1414。

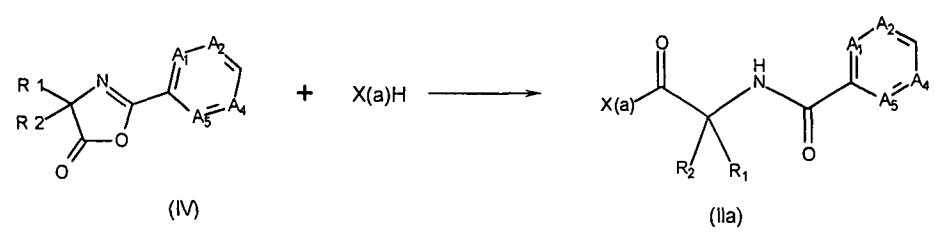
流程 1



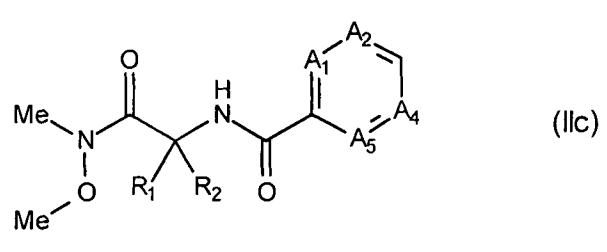
具有式 IIa 的化合物（其中 A1、A2、A4、A5、R1 和 R2 係如在式 I 下所定義的，其中 X(a) 係如上所定義的）可以根據流程 2 來製備，藉由具有式 IV 的吡內酯（其中 A1、A2、A4、A5、R1 和 R2 係如在式 I 下所定義的）與親核試劑 X(a)H 的開環反應。X(a)H 係例如 C1-C6 烷醇、雜原子-取代的 C1-C6 乙醇、雜原子-取代的二烷基胺或其鹽，較佳的是 *N,O*-二甲基鹽酸羥胺或咪啉，該反應係在溶劑中，例如二氯甲烷、氯仿、甲苯、DMF、二甲基乙醯胺、NMP，但是較佳的是二氯甲烷，在鹼的存在下，持續 1 天與兩周之間，較佳的是 1 天至一周，並且在 0°C 至 30°C 之間，較佳的是 20°C 至 25°C。使用的典型鹼係吡啶和三乙胺。吡內酯的這樣類型的開環已經描述於文獻中，例如從 WO 2009/127722、從 J. Comb. Chem. (《組合化學雜誌》) 2005, 7, 843、從 J. Chem. Soc. Perkin Trans. (《化學學會雜誌，帕金學報》) 2, 741-8

或從 Helvetica Chimica Acta 《瑞士化學學報》), 1987, 70, 102。具有式 IV 類型的吡內酯可以根據描述於例如 J. Chem. Soc. Perkin Trans. (《化學學會雜誌, 帕金學報》) 2, 1993, 741 或 J. Comb. Chem. (《組合化學雜誌》) 2005, 7, 843 中的程序進行製備。

流程 2

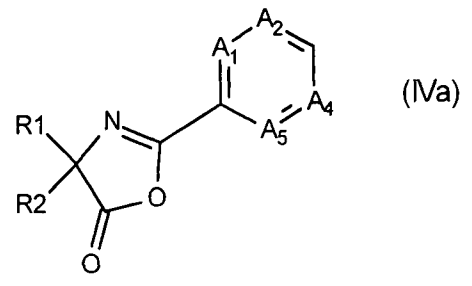


一組具有式 II 的化合物係具有式 IIc 的那些



其中 A1、A2、A4 和 A5 彼此獨立地是 N、CH 或 CR₆，
其中在包含 A1、A2、A4 和 A5 的環中的 N 原子的數目係 0、1 或 2，
R₆ 彼此獨立地是鹵素、氰基、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、C1-C4-烷氧基、或 C1-C4-鹵代烷氧基並且 R₁ 和 R₂ 係如對於式 (I) 所定義的；其條件係當 A1 係 CH 或 C-CH₃ 時，A4 和 A5 中至少之一係 N 或 CR₆。該等具有式 IIc 的化合物係新穎的並且也是本發明的部分。

一組具有式 IV 的化合物係具有式 IVa 的那些



其中 A1、A2、A4 和 A5 彼此獨立地是 N、CH 或 CR₆，其中在包含 A1、

A2、A4 和 A5 的環中的 N 原子的數目係 0、1 或 2，R6 彼此獨立地是鹵素、氰基、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、C1-C4-烷氧基、或 C1-C4-鹵代烷氧基，並且 R1 和 R2 係如對於式 (I) 所定義的；其條件係當 A1 係 CH 或 C-C1-C4-烷基時，A2、A4 和 A5 中至少之一係 N 或 CR6。

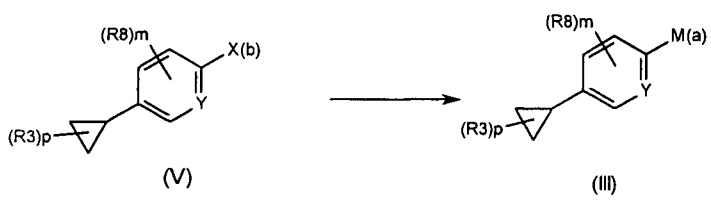
在實施方式中，具有式 (IVa) 的化合物係其中 A1 係 N 或 CR6，A2、A4 和 A5 彼此獨立地是 N、CH 或 CR6，其中在包含 A1、A2、A4 和 A5 的環中的 N 原子的數目係 0、1 或 2，R6 彼此獨立地是氫、鹵素、氰基、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、C1-C4-烷氧基、以及 C1-C4-鹵代烷氧基，R6 係鹵素、氰基、C1-4 鹵代烷基、C1-4 烷氧基、或 C1-4 鹵代烷氧基，並且 R1 和 R2 係如對於式 (I) 所定義的。

在實施方式中，獨立於其他實施方式，具有式 (IVa) 的化合物係其中 A1、A2、A4 和 A5 彼此獨立地是 N、CH 或 CR6，其中在包含 A1、A2、A4 和 A5 的環中的 N 原子的數目係 0、1 或 2，R6 彼此獨立地是鹵素、氰基、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、C1-C4-烷氧基、或 C1-C4-鹵代烷氧基，並且 R1 和 R2 係如對於式 (I) 所定義的；其條件係當 A1 係 CH 或 C-C1-C4-烷基時，A2、A4 和 A5 中至少之一係 N。

具有式 III 之化合物（其中 R3、p、R8、m 和 Y 係如在式 I 下所定義的，並且 M(a) 係金屬，例如鹼金屬（如鋰）或鹼土金屬鹵化物，例如氯化鎂或溴化鎂）可以根據流程 3 來製備，藉由具有式 V 之化合物（其中 R3、p、R8、m 和 Y 係如在式 I 下所定義的並且 X(b) 係離去基團，如鹵素，較佳的是氯化物或溴化物）與有機鋰、鹼金屬、有機鹼土試劑或鹼土金屬的金屬化作用，這係在溶劑中，如 THF、二乙醚、TBME，較佳的是 THF 和二乙醚，持續 10 分鐘至 1 小時之間，並且在 -80°C 至 25°C 之間，較佳的是在 -80°C 至 -20°C 之間。有機鹼的典型實例係正丁基鋰或苯基鋰。有機鹼土試劑的典型實例係異丙基氯化鎂，不在或在 LiCl（“圖波-格氏（turbo-Grignard）”）

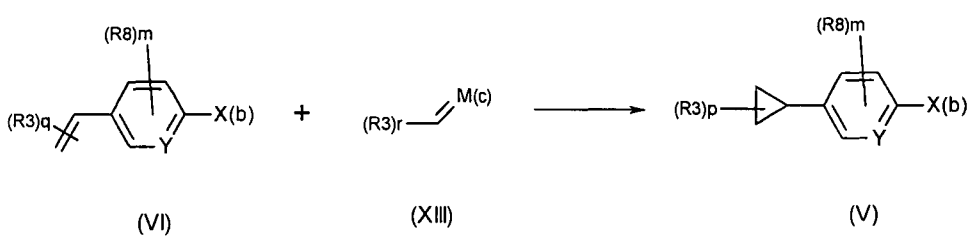
的存在下。鹼土金屬的典型實例係可以被不同試劑（包括碘）活化的鎂。具有式 V 的化合物係可商購的或可以藉由已知的方法來合成。一種這樣的方法示於下面的流程 4 中。

流程 3



具有式 V 的化合物可以藉由具有式 VI 的苯基或吡啶基烯烴（其中 R8、m、和 R3 係如在式 R1 下所定義的並且 q 係 0-2）的環丙烷化來製備。用於環丙烷化的試劑係具有式 XIII 的碳烯，其中 R3 係如在式 I 下所定義的，r 係 0-2，並且 Mc 係可以與配位元基連接的金屬或金屬鹽。試劑 XIII 可以按化學計量地製備和使用或它可以從碳烯先質和與配位元基連接的金屬、或金屬鹽原位地或初生地產生，該金屬或金屬鹽可以被催化地使用。其鹽和錯合物通常被用於這一目的的金屬係 Fe、Rh、Co 和 Ru。碳烯先質典型地是二鹵代烷烴或重氮化合物、或該等的先質。此類方法被描述於 H. M. W. Davies（大衛斯）Organic Reactions（《有機反應》）2001, 1 中。替代性方法係使用有機鋅化合物代替 XIII 的西蒙斯-史密斯反應，描述於 A. B. Charette（沙雷特）等人 Organic Reactions（《有機反應》）2001, 58, 1 中。

流程 4

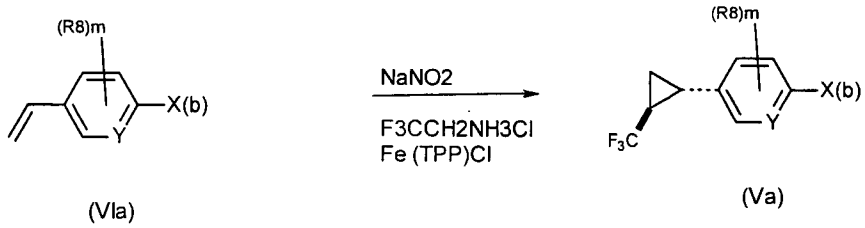


這種方法的一個具體實例係根據流程 4a 的具有式 Va 之化合物的製



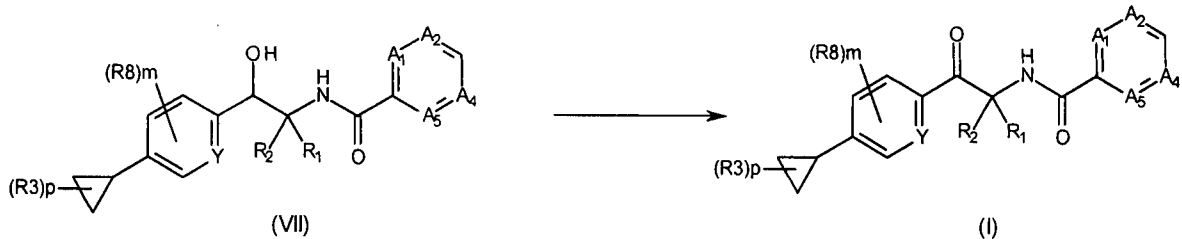
備，其中 R8、m、和 Y 係如在式 I 下所定義的並且 X(b) 係如在式 V 下所定義的。在金屬催化劑（例如 Fe(TPP)Xd，其中 TPP 係四苯基卟啉並且 Xd 係鹵化物、羧化物、或磺酸基團）的存在下，藉由用原位產生的三氟甲基重氮甲烷對其進行處理來將具有式 VIa 之乙烯基芳香族化合物（其中 R8、m、Y 和 X(b) 係如在式 VI 下所定義的）轉化為具有式 Va 之反式三氟甲基環丙烷。藉由用亞硝酸鈉水溶液處理 2,2,2-三氟乙胺鹽產生三氟甲基重氮甲烷。這一方法描述於 Angew. Chem. Int. Ed.（《德國應用化學》）2010, 49, 938 和 JP 2011/105691 中。然而，這一方法僅針對小於 1 g 的量進行了描述。已經發現，將這一方法按比例調整至 1 g 或更多導致溫度的不可接受的升高。此外，大體積係缺點。現在已經發現，在金屬催化劑的存在下，向 2,2,2-三氟乙胺鹽溶液中受控添加亞硝酸鈉溶液允許更安全的受控放熱曲線和更大體積的產量。可以使用外部冷卻來除去反應熱，因此允許更快的過程。該反應僅在一旦添加亞硝酸鹽溶液時發生。藉由控制亞硝酸鹽的添加，控制該反應，並且可以將溫度保持在安全範圍內。這一溫度範圍較佳的是在 0°C 與 100°C 之間，更佳的是在 0°C 與 50°C 之間，更佳的是在 10°C 與 40°C 之間。可以藉由以具體的速率添加亞硝酸鹽溶液或藉由部分地添加亞硝酸鹽溶液、或藉由兩者的組合來控制添加。這一方法係優越並新穎的並且係本發明的部分。可以使用許多描述於 H. M. W. Davies（大衛斯）Organic Reactions（《有機反應》）2001, 1 中的金屬催化劑來用於這一方法。較佳的是 Fe、Co、和 Ru 鹽以及錯合物。更佳的是 Fe 錯合物。最佳的是 Fe(TPP)Xd，其中 TPP 係四苯基卟啉並且 Xd 係鹵化物、羧化物、或磺酸基團。更佳的是，Xd 係鹵化物，特別是氯化物。

流程 4a



具有式 I 之化合物可以根據流程 5 來製備，藉由用氧化試劑對具有式 VII 的醇（其中 A1、A2、A4、A5、R₁、R₂、Y、R₃、p、R₈ 以及 m 係如在式 I 下所定義的）的氧化作用。用於這樣的類型的轉化的典型試劑係基於鉻的氧化試劑，例如柯林斯試劑（Collins reagent）、鐘斯試劑（Jones reagent）、氯鉻酸吡啶鎊、重鉻酸吡啶鎊；基於錳的氧化試劑，例如 MnO₂ 和 KMnO₄；基於過碘烷的氧化試劑，例如描述於 D.L. Boger（柏格），Modern Organic Synthesis（《現代有機合成》），TSRI 出版社，La Jolla Ca（加利福尼亞州拉由拉市），1999 pp. 87-93 中的戴斯-馬丁過碘烷（Dess-Martin periodinane）。

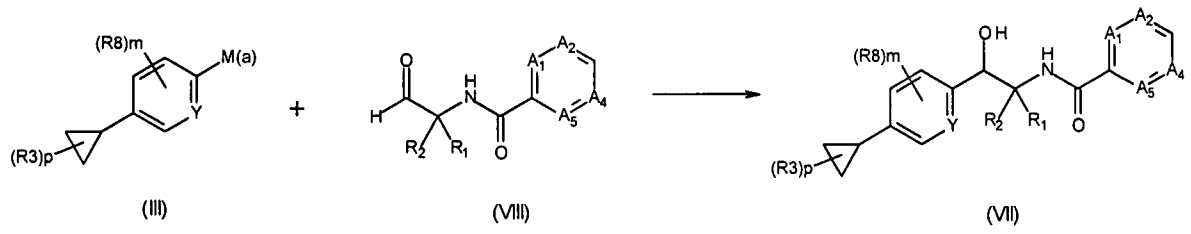
流程 5



具有式 VII 之化合物（其中 A1、A2、A3、A4、R₁、R₂、Y、R₃、p、R₈ 以及 m 係如在式 I 下所定義的）可以根據流程 6 來製備，藉由具有式 III 的有機金屬化合物（其中 R₃、p、R₈、Y 和 m 係如在式 I 下所定義的，並且 M(a) 係金屬，例如鹼金屬（例如鋰）或鹼土金屬鹵化物（例如氯化鎂或溴化鎂））與具有式 VIII 之醛（其中 A1、A2、A4、A5、R₁ 和 R₂ 係如在式下所定義的）的反應，這係在溶劑中，例如 THF、二乙醚、TBME，較佳的是 THF，持續 1 小時與 5 小時之間，較佳的是 1 與 2 小時之間，並且在 -80°C 至 45°C 之間，較佳的是 -80°C 至 25°C。此類反應的實例從文獻中已知，例

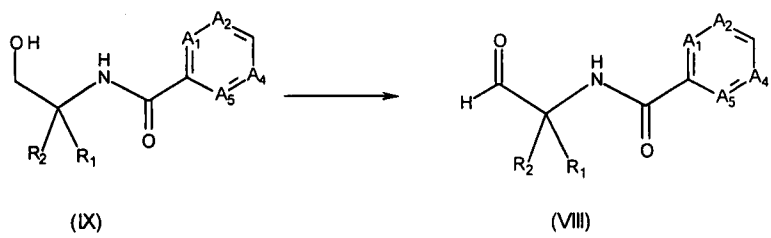
如從 J. Comb. Chem. (《組合化學雜誌》) 2005, 7, 843。

流程 6



具有式 VIII 之醛（其中 A1、A2、A4、A5、R₁ 和 R₂ 係如在式 I 下所定義的）可以根據流程 7 來製備，藉由用氧化試劑對具有式 IX 之醇（其中 A1、A2、A4、A5、R₁、和 R₂ 係如在式 I 下所定義的）的氧化作用。用於這樣的類型的轉化的典型試劑係基於鉻的氧化試劑，例如柯林斯試劑（Collins reagent）、鐘斯試劑（Jones reagent）、氯鉻酸吡啶鎂、重鉻酸吡啶鎂；基於錳的氧化試劑，例如 MnO₂ 和 KMnO₄；基於鈎的氧化試劑，例如 TPAP；基於過碘烷的氧化試劑，例如戴斯-馬丁過碘烷（Dess-Martin periodinane）；或藉由使用如描述於 D.L. Boger（柏格），Modern Organic Synthesis (《現代有機合成》)，TSRI 出版社，La Jolla Ca（加利福尼亞州拉由拉市），1999 pp. 87-93 中的斯旺（Swern）或莫法特-普菲茨納（Moffat-Pfitzner）氧化作用。

流程 7

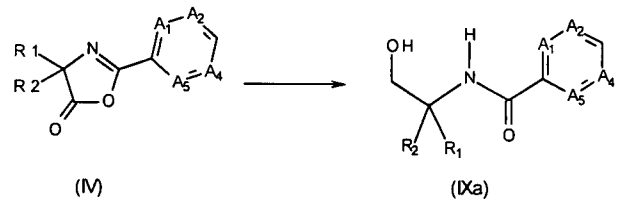


具有式 IXa 的化合物（其中 A1、A2、A4、A5、R₁、R₂ 係如在式 I 下所定義的）可以根據流程 8 來製備，藉由用還原劑對具有式 IV 之吡內酯（其中 A1、A2、A4、A5、R₁、R₂ 係如在式 I 下所定義的）的開環還原。可以使用的還原劑係例如氫化鋁還原劑，如氫化鋁鋰（LiAlH₄）、氫化二異丁基鋁（DIBALH）；硼氫化物還原劑，例如列舉於 D.L. Boger（柏格），Modern Organic



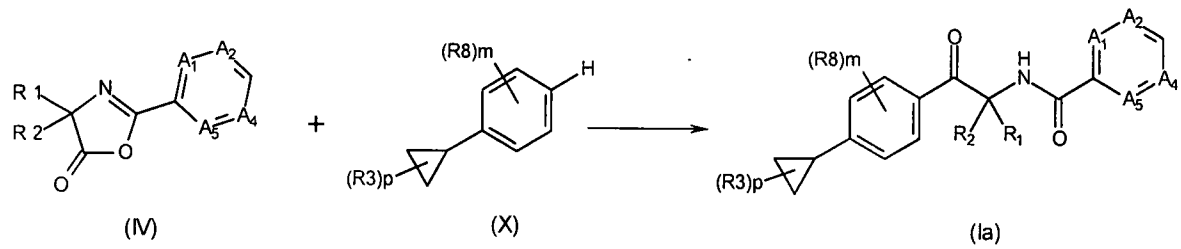
Synthesis (《現代有機合成》), TSRI 出版社, La Jolla Ca (加利福尼亞州拉由拉市), 1999 pp. 87-93 中的硼氫化鈉 (NaBH₄)、硼氫化鋰 (LiBH₄)。吡內酯的這樣類型的開環還原例如從 Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 1(《化學學會雜誌, 帕金學報 1》), 1983, 979、從 Bioorg. Chem. Lett. (《生物有機化學快報》) 2003, 13, 1883、從 J. Comb. Chem. (《組合化學雜誌》) 2005, 7, 843 已知。

流程 8



具有式 Ia 的化合物 (其中 A1、A2、A4、A5、R₁、R₂、R₃、p、R₈ 以及 m 係如在式 I 下所定義的, 並且其中 Y 係 C-H) 可以根據流程 9 來製備, 藉由使具有式 IV 之吡內酯 (其中 A1、A2、A4、A5、R₁、R₂ 係如在式 I 下所定義的) 與具有式 X 之化合物 (其中 R₃、p、R₈ 和 m 係如在式 I 下所定義的) 進行反應, 這係在路易士酸 (例如基於鋁的路易士酸, 較佳的是三氯化鋁) 的存在下, 在可以是具有式 X 之化合物過量的溶劑中, 持續 30 min 與 5 小時之間, 較佳的是 30 min 至 1 小時之間, 並且在 -20°C 至 45°C 之間, 較佳的是 0°C 至 25°C。

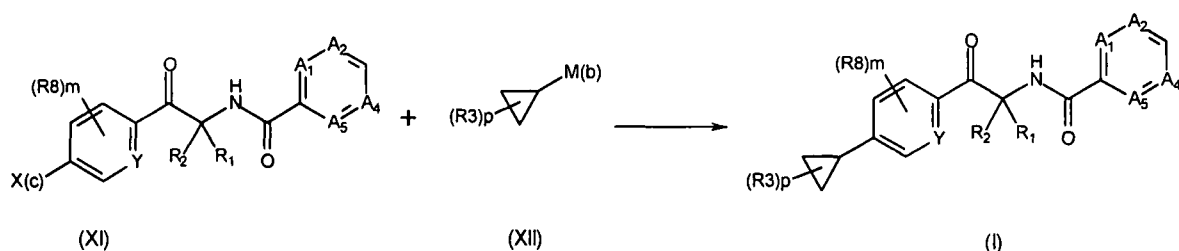
流程 9



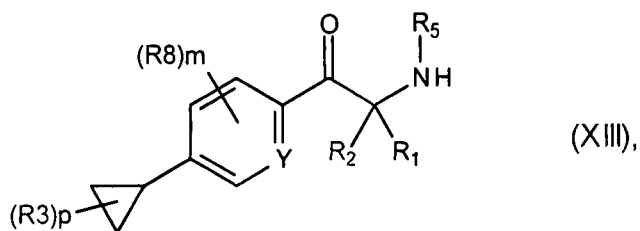
具有式 I 之化合物可以根據流程 10 來製備, 藉由在基於過渡金屬的催

化劑（例如基於鈹的催化劑）和鹼的存在下，經由交叉偶合反應使具有式 XI 之化合物（其中 A1、A2、A4、A5、R₁、R₂、Y、R₈ 以及 m 係如在式 I 下所定義的並且 X(c) 係選自鹵素（較佳的是氯和溴）、或三氟甲磺酸鹽、甲磺酸鹽或甲苯磺酸鹽的離去基團）與具有式 XII 之環丙基供體（其中 R₃ 和 p 係如在式 I 下所定義的，並且 Mb 係官能化金屬或類金屬，例如硼酸鹽、硼酸、硼酸酯（如酞酯）、三氟硼酸鹽）進行反應。這樣類型的經由交叉偶合的環丙基化從文獻中已知，例如從 Synthesis（《合成》），2000, 1095，從 Tetrahedron Lett.（《四面體快報》）2002, 43, 6987，從 Tetrahedron Lett.（《四面體快報》）2010, 51, 1009，從 J. Org. Chem.（《有機化學雜誌》）2008, 73, 7481，從 J. Org. Chem.（《有機化學雜誌》）2010, 75, 6677，從 J. Org. Chem.（《有機化學雜誌》）2011, 76, 8126。具有式 XII 的環丙基化試劑係可商購的或可以根據描述於例如 Tetrahedron Lett.（《四面體快報》）2002, 43, 6987、Tetrahedron Lett.（《四面體快報》）2010, 51, 1009、J. Org. Chem.（《有機化學雜誌》）2010, 75, 6677 中的程序進行製備。當 M(b) 係例如 Bu₃Sn、ZnCl、或 ZnBr 時，其他交叉偶合反應（例如斯蒂爾（Stille）和奈格施（Negishi））是可能的。

流程 10

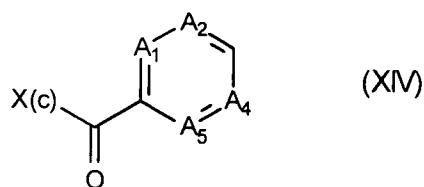


具有式 I 之化合物可以藉由以下製備：使具有式 XIII 之化合物



其中 R₃、p、R₈、m、Y、R₁、以及 R₂ 係如在式 I 下所定義的；與具有

式 XIV 之醯化劑進行反應



其中 A1、A2、A4 和 A5 係如在式 I 下所定義的，並且 X(c) 係鹵素、羥基或 C₁₋₆ 烷氧基，較佳的是氯，該反應係在鹼(例如三乙胺、胡寧氏鹼(Hunig base)、碳酸氫鈉、碳酸鈉、碳酸鉀、吡啶或喹啉，但是較佳的是三乙胺)的存在下，並且在溶劑中，例如二乙醚、TBME、THF、二氯甲烷、氯仿、DMF 或 NMP 中，持續在 10 分鐘至 48 小時之間，較佳的是 12 至 24 小時之間，並且在 0°C 至回流之間，較佳的是 20°C 至 25°C 進行的。

當 X(c) 係羥基時，可以使用偶合劑，例如苯并三唑-1-基氧基三(二甲胺基)磷鎢六氟磷酸鹽，雙-(2-側氧-3-噁唑啉基)-氯化磷 (BOP-Cl)，N,N' -二環己基碳二亞胺 (DCC) 或 1,1' -羰基-二咪唑 (CDI)。

清楚的是，可以藉由基團 R1、R2、R3、p、R8 以及 m 的合成修飾來將具有式 (I) 之化合物轉化為其他具有式 (I) 之化合物。類似地，這樣的轉化可以在中間體 (II)-(XII) 上進行。已知存在大量適合的已知的標準方法，例如烷基化、鹵化、醯化、醯胺化、肟化、氧化以及還原。適合的製備方法的選擇取決於該等中間體中的取代基的特性(反應性)。

該等反應物可以在鹼的存在下進行反應。合適的鹼的實例係鹼金屬或鹼土金屬氫氧化物、鹼金屬或鹼土金屬氯化物、鹼金屬或鹼土金屬醯胺、鹼金屬或鹼土金屬醇化物、鹼金屬或鹼土金屬乙酸鹽、鹼金屬或鹼土金屬碳酸鹽、鹼金屬或鹼土金屬二烷基醯胺或鹼金屬或鹼土金屬烷基矽基醯胺、烷基胺、仲烷基二胺、游離的或 N-烷基化的、飽和或不飽和的環烷基

胺、鹼性雜環類、銨氫氧化物以及碳環胺類。可以提及的實例係氫氧化鈉、氫化鈉、胺基鈉、甲醇鈉、乙酸鈉、碳酸鈉、三級丁醇鉀、氫氧化鉀、碳酸鉀、氫化鉀、二異丙胺基鋰、雙(三甲基矽基)醯胺鉀、氫化鈣、三乙胺、二異丙基乙胺、三仲乙基二胺、環己胺、N-環己基-N,N-二甲胺、N,N-二乙苯胺、吡啶、4-(N,N-二甲胺基)吡啶、吡啶環、N-甲基咪啉、苄基三甲基銨氫氧化物以及 1,8-二氮雜二環[5.4.0]十一-7-烯 (DBU)。

該等反應物可以按照原樣彼此進行反應，即：不用加入溶劑或稀釋劑。然而，在大多數情況下，加入惰性溶劑或稀釋劑或該等的混合物係有利的。如果該反應係在鹼的存在下進行，則該等過量使用的鹼（例如三乙胺、吡啶、N-甲基咪啉或 N,N-二乙苯胺）還可以作為溶劑或稀釋劑。

該反應有利地是在從大約 -80°C 至大約 $+140^{\circ}\text{C}$ 的溫度下進行，較佳的是從大約 -30°C 至大約 $+100^{\circ}\text{C}$ ，在許多情況下是在環境溫度與大約 $+80^{\circ}\text{C}$ 之間。

具有式 (I) 之化合物能以本身已知的方法轉化為另一種具有式 (I) 之化合物，這係藉由以常規方式將該起始的具有式 (I) 之化合物的一個或多個取代基用根據本發明的另一個或其他的取代基的替代來實現的。

取決於在每種情況中適合的該等反應條件和起始物質的選擇，有可能，例如，在一個反應步驟中僅將一個取代基用根據本發明的另一個取代基置換，或者在同一個反應步驟中可以將多個取代基用根據本發明的其他取代基來置換。

具有式 (I) 的該等化合物的鹽能以本身已知的方式進行製備。因此，例如，具有式 (I) 之化合物的酸加成鹽係藉由用適合的酸或合適的離子交換試劑進行處理來獲得的，並且與鹼的鹽係藉由用適合的鹼或用合適的離子交換試劑進行處理來獲得的。鹽的選擇取決於它對使用的化合物的耐受

性，如農業的或生理的耐受性。

具有式 (I) 之化合物的鹽能以常規方式轉化為游離的化合物 I、酸加成鹽（例如藉由用合適的鹼性化合物或用合適的離子交換試劑進行處理）以及鹼鹽（例如藉由用合適的酸或用合適的離子交換試劑進行處理）。

具有式 (I) 之化合物的鹽能以本身已知的方式轉化為具有式 (I) 之化合物的其他鹽、酸加成鹽，例如轉變成為其他酸加成鹽，例如藉由在合適的溶劑中用酸的合適的金屬鹽（比如鈉、鋇或銀鹽，例如用乙酸銀）來處理無機酸的鹽（比如鹽酸鹽），在該溶劑中，所形成的無機鹽（例如氯化銀）係不溶的並且因此從該反應混合物中沈澱出。

取決於該程序或反應條件，具有成鹽特性的該等具有式 (I) 之化合物能以游離形式或鹽的形式獲得。

處於游離形式或鹽形式的具有式 (I) 之化合物的非鏡像異構物混合物或外消旋物的混合物（它們的獲得可以取決於已選定的起始材料和程序）能夠在該等組分的物理化學差異的基礎上，例如藉由分步結晶、蒸餾和/或層析法用已知的方法分離成純的非鏡像異構物或外消旋物。

鏡像異構物混合物（比如外消旋物）可以藉由類似的方法獲得，它們可以藉由已知的方法被拆分為旋光對映體，比如，藉由從旋光活性的溶劑進行重結晶；藉由利手性吸附劑層析法，例如乙醯纖維素高效液相層析法（HPLC）；在合適的微生物的輔助下，藉由利用特異性的固定化酶切割；在只有鏡像異構物係複合物的情況下，經由包容化合物的形成，例如利用手性冠醚；或者藉由轉變成為非鏡像異構物的鹽，例如藉由將鹼性終端產物外消旋物與具有光學活性的酸（比如羧酸，例如樟腦酸、酒石酸或蘋果酸，或磺酸，例如樟腦磺酸）進行反應，並將可以用這種方法獲得的非鏡像異構物混合物進行分離（例如藉由根據它們不同溶解度的分步結晶）以給出該等非鏡像異構物，從該等非鏡像異構物藉由合適的試劑（例如鹼性

試劑)的作用可以釋放所希望的鏡像異構物。

純的非鏡像異構物或鏡像異構物可以根據本發明來獲得，不僅是藉由分離合適的異構物混合物，還可以是藉由普遍已知的非對映立體選擇性或對映選擇性合成之方法，例如藉由利用合適的立體化學的起始材料進行根據本發明的方法。

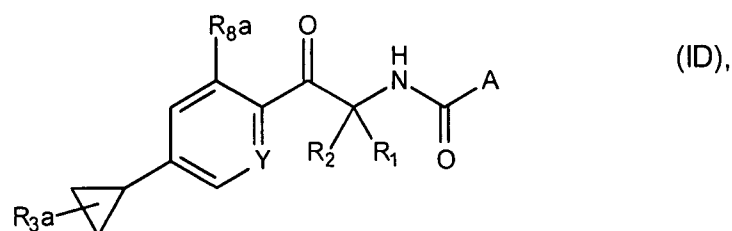
可以藉由將具有式 (I) 之化合物與適合的氧化劑 (例如 H_2O_2 /尿素加合物) 在酸酐 (例如，三氟乙酸酐) 存在下進行反應製備 N-氧化物。此類氧化從文獻，例如，從《藥物化學雜誌》(J. Med. Chem., 32 (12), 2561-73, 1989) 或 WO 00/15615 或懷特，《科學》(C. White, Science, vol 318, p.783, 2007) 中已知。

如果該等單獨的組分具有不同的生物活性，有利的是在每種情況下離析或合成該生物學上更有效的異構物，例如鏡像異構物或非鏡像異構物，或者異構物混合物，例如鏡像異構物混合物或非鏡像異構物混合物。

該等具有式 (I) 之化合物以及適當時其互變異構物 (在每種情況下處於游離形式或鹽形式) 如果適當的話還能以水合物的形式獲得和/或包括其他的溶劑，例如可以用於以固體形式存在的化合物的結晶的那些。

表 1 至 18：具有式 ID 之化合物

藉由使以下在下表 1 至表 18 中列出的具有式 (ID) 之個體化合物可得，對本發明做了進一步地說明。



在表 Y 下面的表 1 至 18 的每一個使得具有式 (ID) 之 29 種化合物可得，其中 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係在表 Y 中定義的取代基並且 A 係如

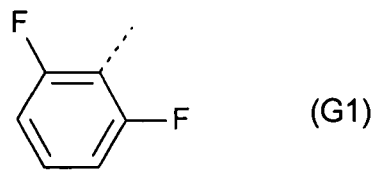
在有關的表 1 至 18 中所定義的。因此表 1 個體化了具有式 (ID) 之 29 種化合物，其中對於表 Y 的每一行，取代基 A 係如在表 1 中定義的；類似地，表 2 個體化了具有式 (ID) 的 29 種化合物，其中對於表 Y 的每一行，取代基 A 係如在表 2 中定義的；表 3 至表 18 以此類推。

表 Y

化合物編號	Y	R1	R2	R3a	R8a
Y.001	CH	Me	Me	H	H
Y.002	CH	Me	Me	2-CF3 (反式)	H
Y.003	CH	Me	Me	2-CF3 (順式)	H
Y.004	CH	Me	Me	2-CH3	H
Y.005	CH	Me	Me	2-CN (反式)	H
Y.006	CH	Me	Me	2-COOMe (反式)	H
Y.007	CH	Me	Me	2-CONHMe	H
Y.008	CH	Me	Me	2-CON(Me)2	H
Y.009	CH	Me	Me	2-NO2	H
Y.010	CH	Me	Me	NHCOMe	H
Y.011	CH	Me	Me	2,2-Br2	H
Y.012	CH	Me	Me	2,2-Cl2	H
Y.013	N	Me	Me	H	H
Y.014	N	Me	Me	2-CF3 (反式)	H
Y.015	N	Me	Me	2-CF3 (順式)	H
Y.016	N	Me	Me	2-CH3	H
Y.017	N	Me	Me	2,2-Cl2	H
Y.018	N	Me	Me	H	H
Y.019	N	Me	Me	H	F
Y.020	N	Me	Me	2-CF3 (反式)	F
Y.021	N	Me	Me	2-CF3 (順式)	F
Y.022	N	Me	Me	2-CH3	F
Y.023	N	Me	Me	2,2-Cl2	F
Y.024	N	Me	Me	H	F
Y.025	CH	cPr		H	H
Y.026	CH	cPr		2-CF3 (反式)	H
Y.027	CH	cPr		2-CF3 (順式)	H
Y.028	CH	cPr		2-CH3	H
Y.029	CH	cPr		2,2-Cl2	H



表 1 提供了具有式 (ID) 的 29 種化合物，其中 A 係



(2,6-二氟苯基)，其中虛線表示基團 A 至醯胺基的附接點，並且 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係如在表 Y 的每一行中所定義的。例如，化合物 1.001 具有以下結構：

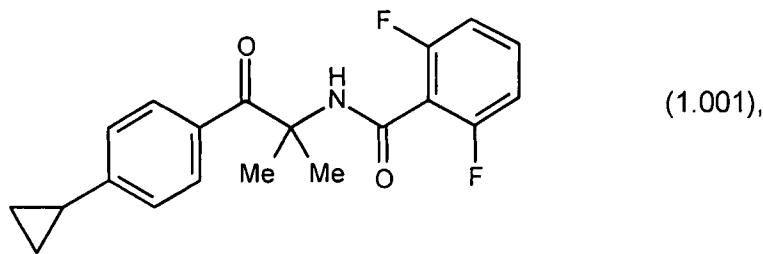


表 2 提供了具有式 (ID) 之 29 種化合物，其中 A 係 2-三氟甲基-苯基 (G2)，並且 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係如在表 Y 的每一行中所定義的。

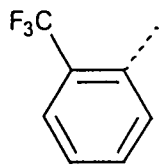


表 3 提供了具有式 (ID) 之 29 種化合物，其中 A 係 2-氟苯基 (G3)，並且 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係如在表 Y 的每一行中所定義的。

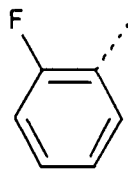


表 4 提供了具有式 (ID) 的 29 種化合物，其中 A 係 3-三氟甲基-2-吡啶基 (G4)，並且 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係如在表 Y 的每一行中所定義的。

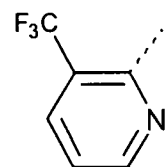


表 5 提供了具有式 (ID) 的 29 種化合物，其中 A 係 3-氯-2-吡啶基(G5)，並且 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係如在表 Y 的每一行中所定義的。

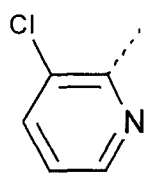


表 6 提供了具有式 (ID) 的 29 種化合物，其中 A 係 2-三氟甲基-3-吡啶基(G6)，並且 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係如在表 Y 的每一行中所定義的。

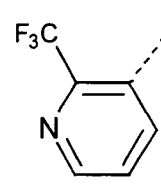


表 7 提供了具有式 (ID) 的 29 種化合物，其中 A 係 2-氯-3-吡啶基(G7)，並且 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係如在表 Y 的每一行中所定義的。

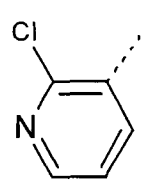


表 8 提供了具有式 (ID) 的 29 種化合物，其中 A 係 3-氟-2-吡啶基(G8)，並且 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係如在表 Y 的每一行中所定義的。

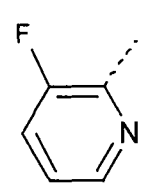


表 9 提供了具有式 (ID) 的 29 種化合物，其中 A 係 3-氯-2-吡嗪基(G9)，並且 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係如在表 Y 的每一行中所定義的。

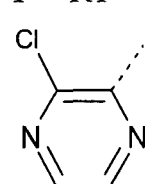


表 10 提供了具有式 (ID) 的 29 種化合物，其中 A 係 3-甲基-2-吡嗪基(G10)，並且 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係如在表 Y 的每一行中所定義的。



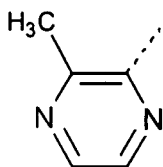


表 11 提供了具有式 (ID) 的 29 種化合物，其中 A 係 3-溴-2-吡啶基 (G11)，並且 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係如在表 Y 的每一行中所定義的。

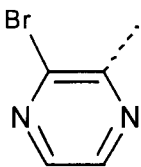


表 12 提供了具有式 (ID) 的 29 種化合物，其中 A 係 3-三氟甲基-2-吡啶基 (G12)，並且 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係如在表 Y 的每一行中所定義的。

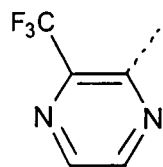


表 13 提供了具有式 (ID) 的 29 種化合物，其中 A 係 3-溴-2-吡啶基 (G13)，並且 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係如在表 Y 的每一行中所定義的。

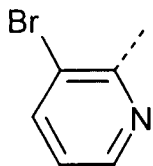


表 14 提供了具有式 (ID) 的 29 種化合物，其中 A 係 2-溴-3-吡啶基 (G14)，並且 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係如在表 Y 的每一行中所定義的。

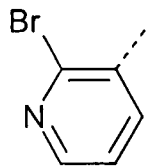


表 15 提供了具有式 (ID) 的 29 種化合物，其中 A 係 3-甲基-2-吡啶基 (G15)，並且 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係如在表 Y 的每一行中所定義的。



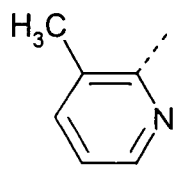


表 16 提供了具有式 (ID) 的 29 種化合物，其中 A 係 3-甲氧基-2-吡啶基 (G16)，並且 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係如在表 Y 的每一行中所定義的。

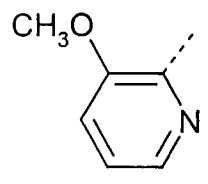


表 17 提供了具有式 (ID) 的 29 種化合物，其中 A 係鄰-甲苯基 (G17)，並且 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係如在表 Y 的每一行中所定義的。

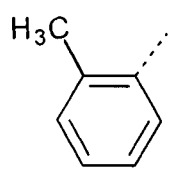
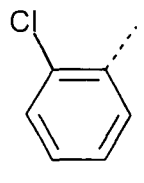


表 18 提供了具有式 (ID) 的 29 種化合物，其中 A 係 2-氯苯基 (G18)，並且 Y、R1、R2、R3a 以及 R8a 係如在表 Y 的每一行中所定義的。



使得具有式 (IIc) 的 36 個實例可得，其中包含 A1、A2、A4 以及 A5 的環對應 G1 至 G18 中的每個並且其中在式 (IIc) 中的取代基 R1 和 R2 對應在式 (ID) 的背景上表 Y 的每一行。所以例如，在 12.001 的背景上，具有式 (IIc) 的化合物將是 R1 & R2 各自是甲基並且該環係 3-三氟甲基-2-吡啶基 (G12)。使得具有式 (IVa) 的 36 個實例可得，其中包含 A1、A2、A4 以及 A5 的環對應 G1 至 G18 中的每個並且其中在式 (IVa) 中的取代基 R1 和 R2 對應在式 (ID) 的背景上表 Y 的每一行。所以例如，在 9.025 的背景上，具有式 (IVa) 的化合物將是 R1 & R2 一起是環丙基並且該環係 3-氯-2-吡啶



基 (G9)。

已經發現具有式 (I) 之化合物用於控制由有害生物和/或真菌導致的損傷。

在實施方式中，具有式 (I) 之化合物可以被用在農業中。

因此，本發明此外針對用於控制由有害生物和/或真菌引起的損害和/或產量損失的方法，該方法包括向有害生物、向有害生物的場所、或向易受有害生物和/或真菌攻擊的植物或向植物繁殖材料施用有效量的具有式 (I) 之化合物。

根據本發明的該等化合物可以用於控制，即限制或毀滅，出現在特別是在植物上，尤其是在農業、園藝和森林中的有用植物和觀賞植物上，或在這樣的植物的器官如果實、花、葉、稈、根莖或根上的有害生物和/或真菌，並且在某些情況下，甚至在較晚的時間點形成的植物器官上仍然針對該等有害生物的保護。

根據本發明的該等具有式 (I) 之化合物在有害生物控制領域中是有防止和/或治療價值的活性成分，即使是以低的施用量施用，它們可以被用於對抗具有殺有害生物劑抗性的有害生物和/或真菌，該等具有式 (I) 之化合物具有非常有利的殺生物範圍並且是溫血物種、魚和植物良好耐受的。

根據本發明的該等化合物可以作用於正常敏感的以及還有抗性的動物有害生物（如昆蟲或蜱蟎目的代表）的所有的或個別的發育階段。根據本發明的該等化合物的殺昆蟲的或殺蟎的活性可以直接地表現自身，即：例如在蛻皮期間有害生物的破壞，其立即或者在一段時間之後發生；或間接地表現自身，例如減少的產卵和/或孵化率，良好的活性相應於至少 50%-60% 的破壞率（死亡率）。

現在已經發現了根據本發明的具有式 I 之化合物具有（用於實用的目

的)，非常有利的保護動物和有用的植物針對線蟲的攻擊與損害的活性範圍。因此，本發明還使得包括本發明的化合物，如式 (I) 的殺線蟲組合物可得。

具有式 (I) 的該等化合物對線蟲的控制尤其有用。因此，在另一個方面，本發明還涉及控制由植物寄生的線蟲（內寄生的-、半內寄生的-以及外寄生的線蟲）對植物或其部分引起損害的方法，尤其是以下植物寄生的線蟲，如根結線蟲（root knot nematodes）、北方根結線蟲（*Meloidogyne hapla*）、南方根結線蟲（*Meloidogyne incognita*）、爪哇根結線蟲（*Meloidogyne javanica*）、花生根結線蟲（*Meloidogyne arenaria*）以及其他根結線蟲屬種類（*Meloidogyne species*）；孢囊形成線蟲（cyst-forming nematodes）、馬鈴薯金線蟲（*Globodera rostochiensis*）以及其他球孢囊線蟲屬種類（*Globodera species*）；禾穀孢囊線蟲（*Heterodera avenae*）、大豆孢囊線蟲（*Heterodera glycines*）、甜菜孢囊線蟲（*Heterodera schachtii*）、紅三葉異皮線蟲（*Heterodera trifolii*）、以及其他異皮線蟲屬種類（*Heterodera species*）；種癭線蟲（Seed gall nematodes）、粒線蟲屬種類（*Anguina species*）；莖及葉面線蟲（Stem and foliar nematodes）、滑刃線蟲屬種類（*Aphelenchoides species*）；刺毛線蟲（Sting nematodes）、長尾刺線蟲（*Eelionolaimus longicaudatus*）以及其他刺線蟲屬種類（*Belonolaimus species*）；松樹線蟲（Pine nematodes）、松材線蟲（*Bursaphelenchus xylophilus*）以及其他傘滑刃屬種類（*Bursaphelenchus species*）；環形線蟲（Ring nematodes）、環線蟲屬種類（*Criconema species*）、小環線蟲屬種類（*Criconemella species*）、輪線蟲屬種類（*Criconemoides species*）、中環線蟲屬種類（*Mesocriconema species*）；莖及鱗球莖線蟲（Stem and bulb nematodes）、腐爛莖線蟲（*Ditylenchus destructor*）、鱗球莖莖線蟲（*Ditylenchus dipsaci*）以及其他莖線蟲屬種類（*Ditylenchus species*）；錐線蟲（Awl nematodes）、錐線蟲屬種類（*Dolichodorus species*）；螺旋線蟲（Spiral

nematodes)、多頭螺旋線蟲 (*Helicotylenchus multicinctus*) 以及其他螺旋線蟲屬種類 (*Helicotylenchus species*)；鞘及鞘形線蟲 (*Sheath and sheathoid nematodes*)、鞘線蟲屬種類 (*Hemicycliophora species*) 以及半輪線蟲屬種類 (*Hemicriconemoides species*)；潛根線蟲屬種類 (*Hirshmanniella species*)；支線蟲 (*Lance nematodes*)、冠線蟲屬種類 (*Hoploaimus species*)；假根結線蟲 (*false rootknot nematodes*)、珍珠線蟲屬種類 (*Nacobbus species*)；針狀線蟲 (*Needle nematodes*)、橫帶長針線蟲 (*Longidorus elongatus*) 以及其他長針線蟲屬種類 (*Longidorus species*)；大頭針線蟲 (*Pin nematodes*)、短體線蟲屬種類 (*Pratylenchus species*)；腐線蟲 (*Lesion nematodes*)、花斑短體線蟲 (*Pratylenchus neglectus*)、穿刺短體線蟲 (*Pratylenchus penetrans*)、彎曲短體線蟲 (*Pratylenchus curvatus*)、古氏短體線蟲 (*Pratylenchus goodeyi*) 以及其他短體線蟲屬種類 (*Pratylenchus species*)；柑桔穿孔線蟲 (*Burrowing nematodes*)、香蕉穿孔線蟲 (*Radopholus similis*) 以及其他內侵線蟲屬種類 (*Radopholus species*)；腎形線蟲 (*Reniform nematodes*)、羅柏氏盤旋線蟲 (*Rotylenchus robustus*)、腎形盤旋線蟲 (*Rotylenchus reniformis*) 以及其他盤旋線蟲屬種類 (*Rotylenchus species*)；盾線蟲屬種類 (*Scutellonema species*)；短粗根線蟲 (*Stubby root nematodes*)、原始毛刺線蟲 (*Trichodorus primitivus*) 以及其他毛刺線蟲屬種類 (*Trichodorus species*)、擬毛刺線蟲屬種類 (*Paratrichodorus species*)；矮化線蟲 (*Stunt nematodes*)、馬齒莧矮化線蟲 (*Tylenchorhynchus claytoni*)、順逆矮化線蟲 (*Tylenchorhynchus dubius*) 以及其他矮化線蟲屬種類 (*Tylenchorhynchus species*)；柑桔線蟲 (*Citrus nematodes*)、穿刺線蟲屬種類 (*Tylenchulus species*)；短劍線蟲 (*Dagger nematodes*)、劍線蟲屬種類 (*Xiphinema species*)；以及其他植物寄生的線蟲種類，如亞粒線蟲屬 (*Subanguina spp.*)、*Hypsoperine spp.*、大刺環線蟲屬 (*Macroposthonia spp.*)、*Melinius spp.*、刻點胞囊屬 (*Punctodera spp.*)、以及

五溝線蟲屬 (*Quinisulcius* spp.)。

特別地，藉由本發明的化合物可以控制該等線蟲種類：根結線蟲屬、異皮線蟲屬、盤旋線蟲屬以及短體線蟲屬。

動物有害生物的實例係：

-來自蟎目，例如，

下毛癭蟎屬 (*Acalitus* spp.)、針刺癭蟎屬、窄癭蟎屬 (*Acaricalus* spp.)、瘤癭蟎屬 (*Aceria* spp.)、粗腳粉蟎、鈍眼蜱屬、銳緣蜱屬、牛蜱屬、短須蟎屬、苔蟎屬、上三節癭蟎屬 (*Calipitimerus* spp.)、皮蟎屬、雞皮刺蟎、表皮蟎屬、始葉蟎屬、癭蟎屬、半跗線蟎屬、璃眼蜱屬、硬蜱屬、小爪蟎屬、鈍緣蜱屬、側多食跗線蟎、全爪蟎屬、桔芸鏽蟎、植食蟎 (*Phytonemus* spp.)、跗線蟎屬、癢蟎屬、扇頭蜱屬、根嗜蟎屬、疥蟎屬、狹跗線蟎屬、跗線屬以及葉蟎屬；

-來自虱目，例如，

血虱屬、長顎虱屬、人虱、天孢瘡屬和木虱；

-來自鞘翅目，例如，

缺隆叩甲屬、*Amphimallon majale*、東方異麗金龜、花象屬、蜉金龜屬、*Astylus atromaculatus*、*Ataenius* spp、*Atomaria linearis*、甜菜脛跳甲、螢葉甲屬 (*Cerotoma* spp)、單葉叩甲屬、根頸象屬、綠金龜、象蟲屬、圓頭犀金龜屬、圓頭犀金龜屬、根螢葉甲屬、*Diloboderus abderus*、食植瓢蟲屬、*Eremnus* spp.、黑異爪蔗金龜、咖啡果小蠹、*Lagria vilosa*、馬鈴薯甲蟲、稻水象屬、*Liogenys* spp、*Maecolaspis* spp、栗色絨金龜、*Megascelis* spp、*Melighetes aeneus*、金龜屬、*Myochrous armatus*、鋸穀盜屬、耳喙象屬 (*Otiorhynchus* spp.)、鰓角金龜屬、斑象屬、麗金龜屬、油菜跳甲屬、*Rhyssomatus aubtilis*、劫根蠹屬、金龜子科、米象屬、麥蛾屬、偽切根蟲屬、*Sphenophorus* spp、大豆莖象、擬步行蟲屬、擬穀盜屬以及斑皮蠹屬；

-來自雙翅目，例如，

伊蚊屬、瘧蚊屬、高粱芒蠅、橄欖果實蠅 (*Bactrocea oleae*)、花園毛蚊、遲眼蕈蚊屬 (*Bradysia spp.*)、紅頭麗蠅、小條實蠅屬、金蠅屬、庫蚊屬、黃蠅屬、寡鬚實蠅屬、地種蠅屬、黑腹果蠅、廁蠅屬、胃蠅屬、*Geomyza tripunctata*、舌蠅屬、皮蠅屬、虱蠅屬、斑潛蠅屬、綠蠅屬、潛蠅屬、家蠅屬、狂蠅屬、癭蚊屬、瑞典麥稈蠅、藜泉蠅、草種蠅屬、繞實蠅屬、*Rivelia quadrifasciata*、*Scatella spp.*、蕈蚊屬、刺蠅屬、虻屬、條蟲屬及大蚊屬；

-來自半翅目，例如，

瘤緣蝽 (*Acanthocoris scabrator*)、綠蝽屬、苜蓿盲蝽、*Amblypelta nitida*、海蝦盾緣蝽 (*Bathycoelia thalassina*)、土長蝽屬、臭蟲屬、*Clavigralla tomentosicollis*、盲蝽屬 (*Creontiades spp.*)、可哥瘤盲蝽、*Dichelops furcatus*、棉紅蝽屬、*Edessa spp.*、美洲蝽屬 (*Euchistus spp.*)、六斑菜蝽 (*Eurydema pulchrum*)、扁盾蝽屬、茶翅蝽、具凹巨股長蝽 (*Horcias nobilellus*)、稻緣蝽屬、草盲蝽屬、熱帶碩蚱屬、捲心菜斑色蝽 (*Murgantia histrionic*)、*Neomegalotomus spp.*、煙盲蝽 (*Nesidiocoris tenuis*)、綠蝽屬、擬長蝽 (*Nysius simulans*)、*Oebalus insularis*、皮蝽屬、壁蝽屬、紅獵蝽屬、可哥盲蝽象、*Scaptocoris castanea*、黑蝽屬 (*Scotinophara spp.*)、*Thyanta spp.*、錐鼻蟲屬、木薯網蝽 (*Vatiga illudens*)；

-來自同翅目，例如，

無網長管蚜屬、*Adalges spp.*、*Agalliana ensigera*、*Agonoscena targionii*、粉虱屬 (*Aleurodicus spp.*)、*Aleurocanthus spp.*、甘蔗穴粉虱、軟毛粉虱 (*Aleurothrixus floccosus*)、甘藍粉虱 (*Aleyrodes brassicae*)、棉葉蟬 (*Amarasca biguttula*)、*Amritodus atkinson*、腎圓盾蚱屬、蚜科、蚜屬、蚱屬 (*Aspidiotus spp.*)、茄溝無網蚜、*Bactericera cockerelli*、小粉虱屬、*Brachycaudus spp.*、甘藍蚜、喀木虱屬、雙尾蚜 (*Cavariella aegopodii Scop.*)、蠟蚱屬、褐圓蚱、網

籽草葉圓蚱、*Cicadella* spp.、大白葉蟬 (*Cofana spectra*)、隱瘤蚱屬、*Cicadulina* spp.、褐軟蚱、玉米黃翅葉蟬、裸粉虱屬、柑橘木虱、麥雙尾蚱、西圓尾蚱屬、小綠葉蟬屬、蘋果綿蚱、葡萄斑葉蟬屬、蠟蛤屬、赤桉木虱 (*Glycaspis brimblecombei*)、菜縊管蚱、*Hyalopterus* spp.、超瘤蚱種、檬果綠葉蟬 (*Idioscopus clypealis*)、*Jacobiasca lybica*、灰飛虱屬、球堅蚱、蠟盾蚱屬、蘿蔔蚱 (*Lopaphis erysimi*)、*Lyogenys maidis*、長管蚱屬、*Mahanarva* spp.、蛾蠟蟬科 (*Metcalfa pruinosa*)、麥無網蚱、*Myndus crudus*、瘤蚱屬、臺灣韭蚱、黑尾葉蟬屬、褐飛虱屬 (*Nilaparvata* spp.)、梨大綠蚱、*Odonaspis ruthae*、寄生甘蔗綿蚱、楊梅緣粉虱、考氏木虱、片盾蚱屬、癭綿蚱屬、玉米蠟蟬、扁角飛虱屬、忽布疣蚱、根瘤蚱屬、動性球菌屬、白盾蚱屬、粉蚱屬、棉盲蝽 (*Pseudatomoscelis seriatus*)、木虱屬、棉蚱 (*Pulvinaria aethiopica*)、笠圓盾蚱屬、*Quesada gigas*、電光葉蟬 (*Recilia dorsalis*)、縊管蚱屬、黑盔蚱屬、帶葉蟬屬、二叉蚱屬、麥蚱屬 (*Sitobion* spp.)、白背飛虱、*Spissistilus festinus*、條斑飛虱 (*Tarophagus Proserpina*)、聲蚱屬、粉虱屬、*Tridiscus sporoboli*、葵粉蚱屬 (*Trionymus* spp.)、非洲木虱、桔矢尖蚱、*Zygina flammigera*、*Zyginidia scutellaris*；

-來自膜翅目，例如，

頂切葉蟻屬、三節葉蜂屬 (*Arge* spp.)、布切葉白蟻屬、莖葉蜂屬、松葉蜂屬、鋸角葉蜂科、松葉蜂 (*Gilpinia polytoma*)、梨實蜂屬、毛蟻屬、小黃家蟻、新松葉蜂屬、農蟻屬、*Slenopsis invicta*、水蟻屬以及胡蜂屬；

-來自等翅目，例如，

家白蟻屬、*Cornitermes cumulans*、楹白蟻屬、大白蟻屬、澳白蟻屬、小白蟻屬、散白蟻屬、熱帶火蟻

-來自鱗翅目，例如，

長翅卷蛾屬、褐帶卷蛾屬、透翅蛾屬、地夜蛾屬、棉葉蟲、*Amylois* spp.、黎豆夜蛾、黃卷蛾屬、銀蛾屬 (*Argyresthia* spp.)、帶卷蛾屬、丫紋夜蛾屬、

棉潛蛾、玉米楷夜蛾、粉斑螟蛾、桃蛀果蛾、禾草螟屬、卷葉蛾屬、越蔓桔草螟 (*Chrysoteuchia topiaria*)、葡萄果蠹蛾、卷葉螟屬、雲卷蛾屬、紋卷蛾屬、鞘蛾屬、磷翅目粉蝶、*Cosmophila flava*、草螟屬、大菜螟、蘋果異形小卷蛾、黃楊木蛾、小卷蛾屬、黃楊絹野螟、杆草螟屬、蘇丹棉鈴蟲、金剛鑽屬、非洲莖螟、粉螟屬、葉小卷蛾屬 (*Epinotia* spp)、細斑燈蛾、*Etiella zinckinella*、花小卷蛾屬、環針單紋蛾、黃毒蛾屬、切根蟲屬、*Feltia jaculifera*、*Grapholita* spp.、綠青蟲蛾、實夜蛾屬、菜螟、切葉野螟屬 (*Herpetogramma* spp)、美國白蛾、番茄蠹蛾、*Lasmopalpus lignosellus*、旋紋潛葉蛾、潛葉細蛾屬、葡萄花翅小卷蛾、*Loxostege bifidalis*、毒蛾屬、潛蛾屬、幕枯葉蛾屬、甘藍夜蛾、煙草天蛾、*Mythimna* spp、夜蛾屬、秋尺蛾屬、*Orniodes indica*、歐洲玉米螟、超小卷蛾屬、褐卷蛾屬、小眼夜蛾、蛀莖夜蛾、*Pectinophora gossypiella*、咖啡潛葉蛾、一星黏蟲、馬鈴薯麥蛾、菜粉蝶、粉蝶屬、小菜蛾、芽蛾屬、尺葉蛾屬、薄荷灰夜蛾、西方豆地香 (*Richia albicosta*)、白禾螟屬 (*Scirpophaga* spp.)、蛀莖夜蛾屬、長須卷蛾屬、灰翅夜蛾屬、棉大卷葉螟、興透翅蛾屬、異舟蛾屬、卷葉蛾屬、粉紋夜蛾、番茄斑潛蠅、以及巢蛾屬；

-來自食毛目，例如，

畜虱屬 (*Damalinea* spp.) 和齧毛虱屬；

-來自直翅目，例如，

蟥屬、小蟥屬、螻蛄屬、馬德拉蜚蟥、飛蝗屬、美國螻蛄 (*Neocurtilla hexadactyla*)、大蟥屬、*Scapteriscus* spp.、以及沙漠蝗屬；

-來自齧蟲目，例如，

書虱屬；

-來自蚤目，例如，

角葉蚤屬、櫛頭蚤屬和開皇客蚤；

-來自縷翅目，例如，

Calliothrips phaseoli、花薊馬屬、陽薊馬屬、褐帶薊馬屬、單親薊馬屬 (*Parthenothrips spp.*)、橙花甘硬薊馬 (*Scirtothrips aurantii*)、*Sericothrips variabilis*、帶薊馬屬、薊馬屬；

-來自縷尾目，例如，

衣魚。

在另一方面，本發明還涉及一種用於控制或防止有用的植物受到植物病原的微生物侵染的方法，其中將具有式 (I) 之化合物作為活性成分施用到植物、其部分或其場所上。根據本發明的具有式 (I) 之化合物的顯著區別在於活性、良好的植物耐受性並且是環境安全的。它們具有非常有用的治療、預防和系統特性，並且用於保護眾多有用的植物。具有式 (I) 之化合物可以被用於抑制或破壞在多種不同的有用植物的植物或植物部分（果實、花、葉子、莖、塊莖、根）上發生的疾病，同時還保護了例如稍後生長的那些植物部分免於植物病原的微生物侵害。還有可能使用具有式 (I) 之化合物作為用於處理植物繁殖材料，特別是種子（果實、塊莖、穀粒）以及植物插條（例如稻米）的拌種劑，用於保護對抗真菌感染連同對抗在土壤中存在的植物病原的真菌。

真菌的實例包括：半知菌綱（例如，葡萄孢屬、梨孢屬、長蠕孢屬、鐮孢黴屬、殼針孢屬、尾孢屬以及支鏈孢屬）；擔子菌綱（例如，絲核菌屬、駝孢鏽菌屬、柄鏽菌屬）；子囊菌綱類（例如黑星菌屬以及白粉菌屬、叉絲單囊殼屬、念珠病菌、鉤絲殼屬）；卵菌綱類（例如，疫黴屬、腐黴屬、單軸黴屬）；接合菌類（例如，根黴屬）；層鏽菌科，特別是層鏽菌屬的那些，例如豆薯層鏽菌，它還被稱為亞洲大豆鏽菌，以及柄鏽菌科的那些，特別是柄鏽菌屬的那些，例如禾柄鏽菌，也稱為莖銹病或黑銹病，它係穀類植物中的問題疾病，以及隱匿柄鏽菌，也稱為褐銹病。

該等植物以及藉由根據本發明的方法保護的該等植物之中的可能的疾病，可以提及：

-小麥，對於控制以下種子疾病：鐮刀菌（雪黴葉枯菌以及粉紅鐮孢菌）、黑腥穗病（小麥網腥黑穗病菌、小麥矮腥黑穗病菌或小麥印度腥黑穗病菌）、殼針孢屬疾病（穎枯殼針孢）以及散黑粉菌；

-小麥，對於控制植物地上部分的以下疾病：穀類眼斑病（*Tapesia yellundae*、*Tapesia acuiformis*）、全蝕病（燕麥全蝕病菌）、根枯病（黃色鐮刀菌（*F. culmorum*）、禾穀鐮刀菌（*F. graminearum*））、黑斑病（禾穀絲核菌）、白粉病（*Erysiphe graminis* forma specie tritici）、銹病（條形柄鏽菌以及隱匿柄鏽菌）以及殼針孢屬疾病（小麥殼針孢以及穎枯殼針孢）；

-小麥以及大麥，對於控制細菌以及病毒疾病，例如大麥黃色花葉病；-大麥，對於控制以下種子疾病：網斑病（麥類核腔菌、大麥網斑病菌以及禾旋孢腔菌）、散黑粉菌（散黑穗病）以及鐮刀菌（雪黴葉枯菌以及粉紅鐮孢菌）；

-大麥，對於控制植物地上部分的以下疾病：穀類眼斑病（*Tapesia yellundae*）、網斑病（大麥網斑病菌以及禾旋孢腔菌）、白粉病（*Erysiphe graminis* forma specie hordei）、矮葉銹病（大麥柄鏽菌）以及葉斑病（大麥雲紋病菌）；

-馬鈴薯，對於控制塊莖疾病（特別是馬鈴薯銀屑病菌、莖點黴結節病（*Phoma tuberosa*）、茄絲核菌、茄病鐮刀菌）、黴病（致病疫黴菌）以及某些病毒（病毒 Y）；

-馬鈴薯，對於控制以下葉面疾病：早枯病（茄鏈格孢菌）、黴病（致病疫黴菌）；

-棉花，對於控制生長自種子的幼嫩植物的以下疾病：猝倒病以及疫腐病（茄絲核菌、尖孢鐮刀菌）以及黑色根腐病（根串珠黴）；

-出產蛋白的植物，例如豌豆，對於控制以下種子疾病：炭疽病（豌豆褐斑病菌、豌豆球腔菌）、鐮刀菌（尖孢鐮刀菌）、灰黴病（灰葡萄孢菌）以及黴病（豌豆霜黴菌）；

-含油植物，例如油菜，用於控制以下種子疾病：甘藍莖點黴、薺苔生鏈格孢菌以及核盤菌；

-玉米，對於控制多種種子疾病：（根黴屬、青黴屬、木黴屬、麴黴屬以及藤倉赤黴）；

-亞麻，對於控制種子疾病：亞麻生鏈格孢（*Alternaria linicola*）；

-深林樹木，對於控制猝倒病（尖孢鐮刀菌、茄絲核菌）；

-水稻，用於控制地上部分的以下疾病：瘟病（稻瘟病）、葉鞘緣的斑病（bordered sheath spot）（茄絲核菌）；

-豆科植物，對於控制種子或生長自種子的幼嫩植物的以下疾病：猝倒病以及疫腐病（尖孢鐮刀菌、粉紅鐮孢菌、茄絲核菌、腐黴菌屬）；

-豆科植物，對於控制地上部分的以下疾病：灰黴病（葡萄孢屬）、白粉病（特別是菊科白粉菌、瓜白粉病菌以及甜椒白粉病菌）、鐮孢黴屬（尖孢鐮刀菌、粉紅鐮孢菌）、葉斑病（分支孢子菌屬）、支鏈孢葉斑病（支鏈孢屬）、炭疽病（炭疽菌屬）、殼針孢葉斑病（殼針孢屬）、黑斑病（茄絲核菌）、黴病（例如萵苣霜黴病菌、霜黴屬、假霜黴屬、疫黴屬）；

-果樹，對於控制地上部分的疾病：念珠菌疾病（果鐮刀念珠菌（*Monilia fructigenae*）、核果褐腐菌（*M. laxa*））、瘡痂病（蘋果黑星病菌）、白粉病（白叉絲單囊殼）；-藤本植物，對於控制以下葉面疾病：特別是灰黴病（灰葡萄孢菌）、白粉病（葡萄鉤絲殼）、黑腐病（葡萄炭疽病（*Guignardia biwelli*））以及黴病（葡萄霜黴病菌）。

-甜菜根，對於地上部分的以下疾病：枯萎尾孢菌（*cercospora blight*）（甜菜褐斑病菌）、白粉病（甜菜白粉病菌（*Erysiphe beticola*））、葉斑病（甜菜

葉斑病菌)。

根據本發明的殺真菌組合物還可以被用於對抗易於在木材上或內部生長的真菌疾病。術語“木材”係指所有類型的木頭種類，以及所有類型的計畫用於建築工作的木頭，例如實木，高密度的木頭，層壓木頭以及膠合板。根據本發明的、用於處理木材的方法主要包括接觸一種或多種本發明的化合物或根據本發明的組合物；這包括例如直接施用、噴霧、浸泡、注射或任何其他適合的手段。

單獨使用時，本發明的化合物能有效地控制正在生長或已經收穫了的農藝學植物的線蟲、昆蟲、蟎類有害生物和/或真菌性病原體，它們還可以與農業中使用的其他生物活性劑組合使用，例如，一種或多種殺線蟲劑、殺昆蟲劑、殺蟎劑、殺真菌劑、殺細菌劑、植物活化劑、殺軟體動物劑以及外激素（化學的或生物學的）。混合處於用作殺有害生物劑形式的本發明的化合物或其組合物與其他殺有害生物劑經常導致更寬的殺有害生物作用範圍。例如，本發明的具有式 (I) 的該等化合物可以有效地與以下化合物結合或組合使用，該等化合物係擬除蟲菊酯、新煙鹼、巨環內酯、二醯胺、磷酸鹽、胺基甲酸酯、環二烯類、甲脒、苯酚錫化合物、氯化烴、苯甲醯基苯基脲、吡咯以及類似物。

藉由添加，例如，一種或多種殺昆蟲、殺蟎、殺線蟲和/或殺真菌的活性劑，根據本發明的該等組合物的活性可以顯著地加寬，並且適合於占主導的環境。具有式 (I) 之化合物與其他殺昆蟲、殺蟎、殺線蟲和/或殺真菌的活性劑的組合還可以具有進一步地、意料之外的優點，該等優點還可以在更寬的含義上描述為協同活性。例如，植物對其更好的耐受性、降低的植物毒性，有害生物或真菌可以在它們的不同發育階段得到控制或者在它們的生產期間（例如，在研磨或者混合過程中，在它們的儲藏或它們的使用過程中）更好地控制其行為。

以下列出的殺有害生物劑連同根據本發明可以使用的化合物意在以實例的方式說明該等可能的組合。

具有式 (I) 之化合物與另一種活性化合物的以下組合係較佳的（縮寫“TX”意指“一種選自上示表 1 至 18 中的每個中的 29 種化合物的化合物，更佳的是下示表 19 和 20，甚至更佳的是一種選自 19.001、19.003、19.004、19.005、19.006、19.007、19.008、19.009、19.010、19.011、19.012、19.013、19.014、19.015、19.017、19.018、19.019、19.020、19.021、19.022、19.023、19.024、19.025、19.026、19.027、19.028、19.029、19.033、19.036、19.037、19.038、19.041、19.042、19.043、19.044、19.045、19.046、19.053、19.054、19.056、19.057、19.059、19.060、19.062 以及 19.064 的化合物”）。

佐劑，該佐劑選自由石油（替代名稱（628）+ TX）組成的物質，

殺蟎劑，該殺蟎劑選自由以下物質組成的組：1,1-二(4-氯苯基)-2-乙氧基乙醇（IUPAC 名稱）（910）+ TX、2,4-二氯苯基苯磺酸酯（IUPAC/化學文摘名）（1059）+ TX、2-氟-N-甲基-N-1-萘乙醯胺（IUPAC 名稱）（1295）+ TX、4-氯苯基苯基砒（IUPAC 名稱）（981）+ TX、阿巴丁（1）+ TX、滅蟎醌（3）+ TX、乙醯蟲脒 [CCN] + TX、氟丙菊酯（9）+ TX、涕滅威（16）+ TX、涕滅砒威（863）+ TX、氯氰菊酯（202）+ TX、賽硫磷（870）+ TX、磺胺蟎酯 [CCN] + TX、胺基硫代鹽（872）+ TX、胺吸磷（875）+ TX、胺吸磷草酸氫鹽（875）+ TX、雙甲脒（24）+ TX、殺蟎特（881）+ TX、三氧化二砷（882）+ TX、AVI 382（化合物代碼）+ TX、AZ 60541（化合物代碼）+ TX、益棉磷（44）+ TX、保棉磷（azinphos-methyl）（45）+ TX、偶氮苯（IUPAC 名稱）（888）+ TX、三唑錫（azacyclotin）（46）+ TX、偶氮磷（azothoate）（889）+ TX、苯菌靈（62）+ TX、苯諾沙磷（benoxafos）（替代名稱）[CCN] + TX、苯蟎特（benzoximate）（71）+ TX、苯甲酸苄酯（IUPAC 名稱）[CCN] + TX、聯苯肼酯（74）+ TX、氟氯菊酯（76）+ TX、樂殺蟎（907）+ TX、

溴滅菊酯（替代名稱）+ TX、溴烯殺（bromocyclene）（918）+ TX、溴硫磷（920）+ TX、乙基溴硫磷（921）+ TX、溴蟊酯（bromopropylate）（94）+ TX、噻嗪酮（buprofezin）（99）+ TX、丁酮威（103）+ TX、丁酮虱威（104）+ TX、丁酮威（butylpyridaben）（替代名稱）+ TX、多硫化鈣（calcium polysulfide）（IUPAC 名稱）（111）+ TX、毒殺芬（camphochlor）（941）+ TX、氯滅殺威（carbanolate）（943）+ TX、甲萘威（115）+ TX、克百威（carbofuran）（118）+ TX、卡波硫磷（947）+ TX、CGA 50' 439（研究代碼）（125）+ TX、滅蟊猛（chinomethionat）（126）+ TX、殺蟊醚（chlorbenside）（959）+ TX、殺蟲脒（964）+ TX、殺蟲脒鹽酸鹽（964）+ TX、溴蟲脒（130）+ TX、敵蟊（968）+ TX、殺蟊酯（chlorfenson）（970）+ TX、敵蟊特（chlorfensulphide）（971）+ TX、氯芬磷（131）+ TX、乙酯殺蟊醇（chlorobenzilate）（975）+ TX、伊托明（chloromebuform）（977）+ TX、滅蟲脒（chloromethiuron）（978）+ TX、丙酯殺蟊醇（chloropropylate）（983）+ TX、毒死蜱（145）+ TX、甲基毒死蜱（146）+ TX、蟲蟊磷（chlorthiophos）（994）+ TX、瓜菊酯（cinerin）I（696）+ TX、瓜菊酯 II（696）+ TX、瓜葉菊素（cinerins）（696）+ TX、四蟊嗪（158）+ TX、氯氰碘柳胺（替代名稱）[CCN] + TX、庫馬磷（174）+ TX、克羅米通（替代名稱）[CCN] + TX、巴毒磷（crotoxyphos）（1010）+ TX、硫雜靈（1013）+ TX、果蟲磷（cyanthoate）（1020）+ TX、丁氟蟊酯（CAS 登記號：400882-07-7）+ TX、三氯氟氰菊酯（196）+ TX、三環錫（199）+ TX、氯氰菊酯（201）+ TX、DCPM（1032）+ TX、DDT（219）+ TX、田樂磷（demephion）（1037）+ TX、田樂磷-O（1037）+ TX、田樂磷-S（1037）+ TX、內吸磷（demeton）（1038）+ TX、甲基內吸磷（224）+ TX、內吸磷-O（1038）+ TX、甲基內吸磷-O（224）+ TX、內吸磷-S（1038）+ TX、甲基內吸磷-S（224）+ TX、內吸磷-S-甲基磺隆（demeton-S-methylsulphon）（1039）+ TX、殺蟊隆（226）+ TX、氯亞胺硫磷（dialifos）（1042）+ TX、二嗪磷（227）+ TX、苯氟磺胺

(230) + TX、敵敵畏(236) + TX、甲氟磷(dicliphos)(替代名稱) + TX、開樂散(242) + TX、百治磷(243) + TX、遍地克(1071) + TX、甲氟磷(dimefox)(1081) + TX、樂果(262) + TX、二甲殺蟎黴素(dinactin)(替代名稱)(653) + TX、消蟎酚(dinex)(1089) + TX、消蟎酚(dinex-diclexine)(1089) + TX、消蟎通(dinobuton)(269) + TX、敵蟎普(dinocap)(270) + TX、敵蟎普-4[CCN] + TX、敵蟎普-6[CCN] + TX、二硝酯(1090) + TX、硝戊酯(dinopenton)(1092) + TX、硝辛酯(dinosulfon)(1097) + TX、硝丁酯(dinoterbon)(1098) + TX、敵惡磷(1102) + TX、二苯砒(IUPAC 名稱)(1103) + TX、雙硫侖(替代名稱)[CCN] + TX、乙拌磷(278) + TX、DNOC(282) + TX、苯氧炔蟎(dofenapyn)(1113) + TX、多拉克丁(替代名稱)[CCN] + TX、硫丹(294) + TX、因毒磷(endothion)(1121) + TX、EPN(297) + TX、依立諾克丁(替代名稱)[CCN] + TX、乙硫磷(309) + TX、益硫磷(ethoate-methyl)(1134) + TX、乙蟎唑(etoxazole)(320) + TX、乙嘧硫磷(etrifos)(1142) + TX、抗蟎唑(fenazaflor)(1147) + TX、喹蟎醚(328) + TX、苯丁錫(fenbutatin oxide)(330) + TX、苯硫威(fenothiocarb)(337) + TX、甲氰菊酯(342) + TX、吡蟎胺(fenpyrad)(替代名稱) + TX、唑蟎酯(fenpyroximate)(345) + TX、芬蟎酯(fenson)(1157) + TX、氟硝二苯胺(fentrifanil)(1161) + TX、氰戊菊酯(349) + TX、氟蟲腓(354) + TX、嘧蟎酯(flucrypyrim)(360) + TX、氟佐隆(1166) + TX、氟蟎噻(flubenzimine)(1167) + TX、氟蟎脲(366) + TX、氟氰戊菊酯(flucythrinate)(367) + TX、聯氟蟎(flunetil)(1169) + TX、氟蟲脲(370) + TX、氟氯苯菊酯(flumethrin)(372) + TX、氟殺蟎(fluorbenside)(1174) + TX、flupyradifurone + TX、氟胺氰菊酯(flualinate)(1184) + TX、FMC 1137(研究代碼)(1185) + TX、抗蟎脘(405) + TX、抗蟎脘鹽酸鹽(405) + TX、安硫磷(formothion)(1192) + TX、胺甲威(formparanate)(1193) + TX、 γ -HCH(430) + TX、果綠啉(glyodin)

(1205) + TX、苜蓿醚 (halfenprox) (424) + TX、庚烯醚 (heptenophos) (432) + TX、十六碳烷基環丙烷羧酸酯 (IUPAC/化學文摘名) (1216) + TX、噻蟲酮 (441) + TX、碘甲烷 (IUPAC 名稱) (542) + TX、水胺硫磷 (isocarbophos) (替代名稱) (473) + TX、*O*-(甲氧基胺基硫代磷醯基)水楊酸異丙酯 (IUPAC 名稱) (473) + TX、伊維菌素 (替代名稱) [CCN] + TX、茉莉菊酯 (jasmolin) I (696) + TX、茉莉菊酯 II (696) + TX、碘硫磷 (jodfenphos) (1248) + TX、林丹 (430) + TX、祿芬隆 (490) + TX、馬拉硫磷 (492) + TX、苜蓿二腈 (malonoben) (1254) + TX、滅蚜磷 (mecarbam) (502) + TX、地胺磷 (mephosfolan) (1261) + TX、甲硫芬 (替代名稱) [CCN] + TX、蟲蟊畏 (methacrifos) (1266) + TX、甲胺磷 (527) + TX、殺撲磷 (529) + TX、滅蟲威 (530) + TX、滅多蟲 (531) + TX、甲基溴 (537) + TX、速滅威 (metolcarb) (550) + TX、速滅磷 (556) + TX、自克威 (mexacarbate) (1290) + TX、米爾蟊素 (557) + TX、殺蟊菌素肟 (milbemycin oxime) (替代名稱) [CCN] + TX、丙胺氟磷 (mipafox) (1293) + TX、久效磷 (561) + TX、茂硫磷 (morphothion) (1300) + TX、莫昔克丁 (替代名稱) [CCN] + TX、二溴磷 (naled) (567) + TX、NC-184 (化合物代碼) + TX、NC-512 (化合物代碼) + TX、氟蚊靈 (nifluridide) (1309) + TX、尼柯黴素 (替代名稱) [CCN] + TX、戊氰威 (nitrilacarb) (1313) + TX、戊氰威 (nitrilacarb) 1 : 1 氯化鋅錯合物 (1313) + TX、NNI-0101 (化合物代碼) + TX、NNI-0250 (化合物代碼) + TX、氧樂果 (氧樂果) (594) + TX、殺線威 (602) + TX、亞異砒磷 (oxydeprofos) (1324) + TX、砒拌磷 (oxydisulfoton) (1325) + TX、pp'-DDT (219) + TX、對硫磷 (615) + TX、氯菊酯 (626) + TX、石油 (替代名稱) (628) + TX、芬硫磷 (1330) + TX、稻豐散 (631) + TX、甲拌磷 (636) + TX、伏殺硫磷 (637) + TX、硫環磷 (phosfolan) (1338) + TX、亞胺硫磷 (638) + TX、磷胺 (639) + TX、辛硫磷 (642) + TX、甲基嘧啶磷 (652) + TX、氯化松

節油 (polychloroterpenes) (傳統名稱) (1347) + TX, 殺蟻黴素 (polynactins) (替代名稱) (653) + TX、丙氯諾 (1350) + TX、丙溴磷 (662) + TX、蟬虱威 (promacyl) (1354) + TX、克蟻特 (671) + TX、胺丙畏 (propetamphos) (673) + TX、殘殺威 (678) + TX、乙噻唑磷 (prothidathion) (1360) + TX、發硫磷 (prothoate) (1362) + TX、除蟲菊酯 I (696) + TX、除蟲菊酯 II (696) + TX、除蟲菊素 (pyrethrins) (696) + TX、噠蟻靈 (699) + TX、啉吡硫磷 (pyridaphenthion) (701) + TX、啉蟻醚 (pyrimidifen) (706) + TX、啉硫磷 (1370) + TX、喹硫磷 (quinalphos) (711) + TX、喹硫磷 (quintiofos) (1381) + TX、R-1492 (研究代碼) (1382) + TX、RA-17 (研究代碼) (1383) + TX、魚藤酮 (722) + TX、八甲磷 (schradan) (1389) + TX、硫線磷 (sebufos) (替代名稱) + TX、塞拉菌素 (selamectin) (替代名稱) [CCN] + TX、SI-0009 (化合物代碼) + TX、蘇硫磷 (sophamide) (1402) + TX、螺蟻酯 (738) + TX、螺甲蟻酯 (739) + TX、SSI-121 (研究代碼) (1404) + TX、舒非侖 (替代名稱) [CCN] + TX、氟蟲胺 (sulfluramid) (750) + TX、治螟磷 (sulfotep) (753) + TX、硫黃 (754) + TX、SZI-121 (研究代碼) (757) + TX、氟胺氰菊酯 (398) + TX、吡蟻胺 (763) + TX、TEPP (1417) + TX、三級丁威 (terbam) (替代名稱) + TX、司替羅磷 (777) + TX、三氯殺蟻砒 (tetradifon) (786) + TX、殺蟻黴素 (tetranactin) (替代名稱) (653) + TX、殺蟻硫醚 (tetrasul) (1425) + TX、噻菲農 (thiafenox) (替代名稱) + TX、抗蟲威 (thiocarboxime) (1431) + TX、久效威 (thiofanox) (800) + TX、甲基乙拌磷 (thiometon) (801) + TX、克殺蟻 (1436) + TX、蘇力菌素 (thuringiensin) (替代名稱) [CCN] + TX、威菌磷 (triamiphos) (1441) + TX、苯噻蟻 (triarathene) (1443) + TX、三唑磷 (820) + TX、唑呀威 (triazuron) (替代名稱) + TX、敵百蟲 (824) + TX、氯苯乙丙磷 (trifenofos) (1455) + TX、甲殺蟻黴素 (trinactin) (替代名稱) (653) + TX、滅蚜硫磷 (847) + TX、氟吡唑蟲 (vaniliprole)

[CCN]和 YI-5302（化合物代碼）+ TX，

殺藻劑，該殺藻劑選自由以下物質組成的組：百殺辛(bethoxazin)[CCN]+ TX、二辛酸銅（IUPAC 名稱）（170）+ TX、硫酸銅（172）+ TX、cybutryne [CCN]+ TX、二氫萘醌（dichlone）（1052）+ TX、雙氯酚（232）+ TX、茵多酸（295）+ TX、三苯錫（fentin）（347）+ TX、熟石灰 [CCN]+ TX、代森鈉（nabam）（566）+ TX、滅藻醌（quinoclamine）（714）+ TX、醌苄胺（quinonamid）（1379）+ TX、西瑪津（730）+ TX、三苯錫乙酸鹽（IUPAC 名稱）（347）和氫氧化三苯錫（IUPAC 名稱）（347）+ TX，

驅蠕蟲劑，該驅蠕蟲劑選自由以下物質組成的組：阿巴丁（1）+ TX、克蘆磷酯（1011）+ TX、多拉克丁（替代名稱）[CCN]+ TX、依馬克丁（291）+ TX、依馬克丁苯甲酸酯（291）+ TX、依立諾克丁（替代名稱）[CCN]+ TX、伊維菌素（替代名稱）[CCN]+ TX、殺蟎菌素肟（替代名稱）[CCN]+ TX、莫昔克丁（替代名稱）[CCN]+ TX、哌吡[CCN]+ TX、塞拉菌素（selamectin）（替代名稱）[CCN]+ TX、多殺菌素（737）和硫菌靈（thiophanate）（1435）+ TX，

殺鳥劑，該殺鳥劑選自由以下物質組成的組：氯醛糖（127）+ TX、異狄氏劑（1122）+ TX、倍硫磷（346）+ TX、吡啶-4-胺（IUPAC 名稱）（23）和土的寧（745）+ TX，

殺細菌劑，該殺細菌劑選自由以下物質組成的組：1-羥基-1H-吡啶-2-硫酮（IUPAC 名稱）（1222）+ TX、4-(喹啉-2-基胺基)苯磺醯胺（IUPAC 名稱）（748）+ TX、8-羥基喹啉硫酸鹽（446）+ TX、溴硝醇（97）+ TX、二辛酸銅（IUPAC 名稱）（170）+ TX、氫氧化銅（IUPAC 名稱）（169）+ TX、甲酚 [CCN]+ TX、雙氯酚（232）+ TX、雙吡硫翁（1105）+ TX、多地辛（1112）+ TX、敵磺鈉（fenaminosulf）（1144）+ TX、甲醛（404）+ TX、汞加芬（替代名稱）[CCN]+ TX、春雷黴素（483）+ TX、春雷黴素鹽酸鹽水合物（483）

+ TX、二(二甲基二硫代氨基甲酸鹽)鎳 (IUPAC 名稱) (1308) + TX、三氯
 甲基吡啶 (nitrapyrin) (580) + TX、辛噻酮 (octhilinone) (590) + TX、奧索
 利酸 (606) + TX、土黴素 (611) + TX、羥基喹啉硫酸鉀 (446) + TX、烯
 丙苯噻唑 (probenazole) (658) + TX、鏈黴素 (744) + TX、鏈黴素倍半硫
 酸鹽 (744) + TX、葉枯酞 (766) + TX 扣硫柳汞 (替代名稱) [CCN] + TX，

生物劑，該生物劑選自以下物質組成的組：棉褐帶卷蛾 GV (替代名稱)
 (12) + TX、放射形土壤桿菌 (替代名稱) (13) + TX、鈍綏蟎屬 (替代名
 稱) (19) + TX、芹菜夜蛾 NPV (替代名稱) (28) + TX、原縷翅縷小蜂 (替
 代名稱) (29) + TX、苜蓿蚜小蜂 (替代名稱) (33) + TX、科曼尼蚜繭蜂
 (替代名稱) (34) + TX、食蚜瘿蚊 (替代名稱) (35) + TX、苜蓿丫紋夜
 蛾 NPV (替代名稱) (38) + TX、堅強芽孢桿菌 (替代名稱) (48) + TX、
 球形芽孢桿菌 Neide (學名) (49) + TX、蘇雲金芽孢桿菌 Berliner (學名)
 (51) + TX、蘇雲金芽孢桿菌鯰澤亞種 (學名) (51) + TX、蘇雲金芽孢桿
 菌以色列亞種 (學名) (51) + TX、蘇雲金芽孢桿菌日本亞種 (學名) (51)
 + TX、蘇雲金芽孢桿菌庫斯塔克亞種 (學名) (51) + TX、蘇雲金芽孢桿菌
 擬步行甲亞種 (學名) (51) + TX、球孢白僵菌 (替代名稱) (53) + TX、
 布氏白僵菌 (替代名稱) (54) + TX、普通草蛉 (替代名稱) (151) + TX、
 孟氏隱唇瓢蟲 (替代名稱) (178) + TX、蘋果蠹蛾 GV (替代名稱) (191)
 + TX、西伯利亞潛蠅離顎繭蜂 (替代名稱) (212) + TX、豌豆潛蠅姬小蜂
 (替代名稱) (254) + TX、麗蚜小蜂 (學名) (293) + TX、漿角蚜小蜂 (替
 代名稱) (300) + TX、美洲棉鈴蟲 NPV (替代名稱) (431) + TX、嗜菌異
 小杆線蟲和異小杆線蟲 (替代名稱) (433) + TX、錨斑長足瓢 (替代名稱)
 (442) + TX、脰介殼蟲跳小蜂 (替代名稱) (488) + TX、盲蝽 (替代名稱)
 (491) + TX、甘藍夜蛾 NPV (替代名稱) (494) + TX、Metaphycus helvolus
 (替代名稱) (522) + TX、金龜子綠僵菌蝗變種 (學名) (523) + TX、金

龜子綠僵菌 *anisopliae* 變種 (學名) (523) + TX、歐洲新松葉蜂 NPV 和紅頭松樹葉蜂 NPV (替代名稱) (575) + TX、小花蝽屬 (替代名稱) (596) + TX、玫煙色擬青黴 (替代名稱) (613) + TX、穿刺巴氏桿菌 (*Pasteuria penetrans*) + TX、多刺巴氏桿菌 (*Pasteuria thornei*) + TX、凱撒巴氏桿菌 (*Pasteuria nishizawae*) + TX、多枝巴氏桿菌 (*Pasteuria ramosa*) + TX、智利捕植蟎 (替代名稱) (644) + TX、甜菜夜蛾核型多角體病毒 (學名) (741) + TX、斯氏線蟲 (替代名稱) (742) + TX、昆蟲病原線蟲 (替代名稱) (742) + TX、夜蛾斯氏線蟲 (替代名稱) (742) + TX、格氏線蟲 (替代名稱) (742) + TX、*Steinernema riobrave* (替代名稱) (742) + TX、*Steinernema riobrave* (替代名稱) (742) + TX、蠅蛄斯氏線蟲 (替代名稱) (742) + TX、斯氏線蟲屬 (替代名稱) (742) + TX、赤眼蜂屬 (替代名稱) (826) + TX、西方盲走蟎 (替代名稱) (844)、以及蠟蚧輪枝菌 (替代名稱) (848) + TX，

土壤消毒劑，該土壤消毒劑選自由以下物質組成的組：碘甲烷 (IUPAC 名稱) (542) 和甲基溴 (537) + TX，

化學消毒劑，該化學消毒劑選自由以下物質組成的組：啞磷嗪 (apholate) [CCN] + TX、bisazir (替代名稱) [CCN] + TX、白消安 (替代名稱) [CCN] + TX、除蟲脲 (250) + TX、dimatif (替代名稱) [CCN] + TX、六甲蜜胺 (hemel) [CCN] + TX、六甲磷 (hempa) [CCN] + TX、甲基涕巴 (metepa) [CCN] + TX、甲硫涕巴 (methiotepa) [CCN] + TX、不育特 (methyl apholate) [CCN] + TX、不孕啞 (morzid) [CCN] + TX、氟幼脲 (penfluron) (替代名稱) [CCN] + TX、涕巴 (tepa) [CCN] + TX、硫代六甲磷 (thiohempa) (替代名稱) [CCN] + TX、硫涕巴 (替代名稱) [CCN] + TX、曲他胺 (替代名稱) [CCN] 和尿烷亞胺 (替代名稱) [CCN] + TX，

昆蟲資訊素，該昆蟲資訊素選自由以下物質組成的組：(E)-癸-5-烯-1-基乙酸酯與(E)-癸-5-烯-1-醇 (IUPAC 名稱) (222) + TX、(E)-十三碳-4-烯-1-

基乙酸酯 (IUPAC 名稱) (829) + TX、(E)-6-甲基庚-2-烯-4-醇 (IUPAC 名稱) (541) + TX、(E,Z)-十四碳-4,10-二烯-1-基乙酸酯 (IUPAC 名稱) (779) + TX、(Z)-十二碳-7-烯-1-基乙酸酯 (IUPAC 名稱) (285) + TX、(Z)-十六碳-11-烯醛 (IUPAC 名稱) (436) + TX、(Z)-十六碳-11-烯-1-基乙酸酯 (IUPAC 名稱) (437) + TX、(Z)-十六碳-13-烯-11-炔-1-基乙酸酯 (IUPAC 名稱) (438) + TX、(Z)-二十-13-烯-10-酮 (IUPAC 名稱) (448) + TX、(Z)-十四碳-7-烯-1-醛 (IUPAC 名稱) (782) + TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-醇 (IUPAC 名稱) (783) + TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-基乙酸酯 (IUPAC 名稱) (784) + TX、(7E,9Z)-十二碳-7,9-二烯-1-基乙酸酯 (IUPAC 名稱) (283) + TX、(9Z,11E)-十四碳-9,11-二烯-1-基乙酸酯 (IUPAC 名稱) (780) + TX、(9Z,12E)-十四碳-9,12-二烯-1-基乙酸酯 (IUPAC 名稱) (781) + TX、14-甲基十八-1-烯 (IUPAC 名稱) (545) + TX、4-甲基壬醛-5-醇與 4-甲基壬醛-5-酮 (IUPAC 名稱) (544) + TX、 α -多隆紋菌素 (α -multistriatin) (替代名稱) [CCN] + TX、西部松小蠹集合資訊素 (brevicomins) (替代名稱) [CCN] + TX、十二碳二烯醇 (coddlelure) (替代名稱) [CCN] + TX、十二碳二烯醇 (coddlemone) (替代名稱) (167) + TX、誘蠅酮 (cuelure) (替代名稱) (179) + TX、環氧十九烷 (disparlure) (277) + TX、十二碳-8-烯-1-基乙酸酯 (IUPAC 名稱) (286) + TX、十二碳-9-烯-1-基乙酸酯 (IUPAC 名稱) (287) + TX、十二碳-8 + TX、10-二烯-1-基乙酸酯 (IUPAC 名稱) (284) + TX、多米尼卡引誘劑 (dominicalure) (替代名稱) [CCN] + TX、4-甲基辛酸乙酯 (IUPAC 名稱) (317) + TX、丁香酚 (替代名稱) [CCN] + TX、南部松小蠹集合資訊素 (frontalin) (替代名稱) [CCN] + TX、誘蟲十六酯 (gossyplure) (替代名稱) (420) + TX、誘殺烯混劑 (grandlure) (421) + TX、誘殺烯混劑 I (替代名稱) (421) + TX、誘殺烯混劑 II (替代名稱) (421) + TX、誘殺烯混劑 III (替代名稱) (421) + TX、誘殺烯混劑 IV (替代名稱) (421) + TX、乙酸十六烯酯 (hexalure) [CCN] + TX、齒小蠹二烯

醇(ipsdienol)(替代名稱)[CCN] + TX、小蠹烯醇(ipsenol)(替代名稱)[CCN] + TX、金龜子性誘劑(japonilure)(替代名稱)(481) + TX、三甲基二氧三環壬烷(lineatin)(替代名稱)[CCN] + TX、利特引誘劑(litlure)(替代名稱)[CCN] + TX、粉紋夜蛾性誘劑(looplure)(替代名稱)[CCN] + TX、誘殺酯(medlure)[CCN] + TX、莫格托莫克酸(megatomoic acid)(替代名稱)[CCN] + TX、誘蟲醚(methyl eugenol)(替代名稱)(540) + TX、誘蟲烯(muscalure)(563) + TX、十八-2,13-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC 名稱)(588) + TX、十八-3,13-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC 名稱)(589) + TX、賀康彼(orfralure)(替代名稱)[CCN] + TX、歐克引誘劑(oryctalure)(替代名稱)(317) + TX、非樂康(ostramone)(替代名稱)[CCN] + TX、誘蟲環(siglure)[CCN] + TX、索迪叮(sordidin)(替代名稱)(736) + TX、食菌甲誘醇(sulcatol)(替代名稱)[CCN] + TX、十四-11-烯-1-基乙酸酯(IUPAC 名稱)(785) + TX、特誘酮(839) + TX、特誘酮 A(替代名稱)(839) + TX、特誘酮 B₁(替代名稱)(839) + TX、特誘酮 B₂(替代名稱)(839) + TX、特誘酮 C(替代名稱)(839) 和 trunc-call(替代名稱)[CCN] + TX，

昆蟲驅避劑，該昆蟲驅避劑選自由以下物質組成的組：2-(辛基硫代)乙醇(IUPAC 名稱)(591) + TX、避蚊酮(butopyronoxyl)(933) + TX、丁氧基(聚丙二醇)(936) + TX、己二酸二丁酯(IUPAC 名稱)(1046) + TX、鄰苯二甲酸二丁酯(1047) + TX、丁二酸二丁酯(IUPAC 名稱)(1048) + TX、避蚊胺[CCN] + TX、避蚊胺 [CCN] + TX、驅蚊酯(dimethyl carbate)[CCN] + TX、乙基己二醇(1137) + TX、己脲 [CCN] + TX、甲喹丁(methoquin-butyl)(1276) + TX、甲基新癸醯胺 [CCN] + TX、胺羰基甲酸酯(oxamate)[CCN] 和羥哌酯 [CCN] + TX，

殺昆蟲劑，該殺昆蟲劑選自由以下物質組成的組：1-二氯-1-硝基乙烷(IUPAC/化學文摘名稱)(1058) + TX、1,1-二氯-2,2-二(4-乙基苯基)乙烷

(IUPAC 名稱)(1056) + TX、1,2-二氯丙烷 (IUPAC/化學文摘名稱)(1062) + TX、帶有 1,3-二氯丙烯的 1,2-二氯丙烷 (IUPAC 名稱)(1063) + TX、1-溴-2-氯乙烷 (IUPAC/化學文摘名稱)(916) + TX、乙酸 2,2,2-三氯-1-(3,4-二氯苯基)乙基酯 (IUPAC 名稱)(1451) + TX、2,2-二氯乙基 2-乙基亞磺基乙基甲基磷酸酯 (IUPAC 名稱)(1066) + TX、二甲基胺基甲酸 2-(1,3-二硫雜環戊烷-2-基)苯基酯 (IUPAC/化學文摘名稱)(1109) + TX、硫氰酸 2-(2-丁氧基乙氧基)乙基酯 (IUPAC/化學文摘名稱)(935) + TX、甲基胺基甲酸 2-(4,5-二甲基-1,3-二氧環戊烷-2-基)苯基酯 (IUPAC/化學文摘名稱)(1084) + TX、2-(4-氯-3,5-二甲苯基氧基)乙醇 (IUPAC 名稱)(986) + TX、2-氯乙基 二乙基 磷酸酯 (IUPAC 名稱)(984) + TX、2-咪唑啉酮 (IUPAC 名稱)(1225) + TX、2-異戊醯基二氫茛-1,3-二酮 (IUPAC 名稱)(1246) + TX、甲基胺基甲酸 2-甲基(丙-2-炔基)胺基苯基酯 (IUPAC 名稱)(1284) + TX、月桂酸 2-硫氰基乙基酯 (IUPAC 名稱)(1433) + TX、3-溴-1-氯丙-1-烯 (IUPAC 名稱)(917) + TX、二甲基胺基甲酸 3-甲基-1-苯基吡唑-5-基酯 (IUPAC 名稱)(1283) + TX、甲基胺基甲酸 4-甲基(丙-2-炔基)胺基-3,5-二甲苯基酯 (IUPAC 名稱)(1285) + TX、二甲基胺基甲酸 5,5-二甲基-3-側氧環己-1-烯基酯 (IUPAC 名稱)(1085) + TX、阿巴丁 (1) + TX、乙醯甲胺磷 (2) + TX、啖蟲脒 (4) + TX、家蠅磷 (替代名稱) [CCN] + TX、乙醯蟲脒 [CCN] + TX、氟丙菊酯 (9) + TX、丙烯腈 (IUPAC 名稱)(861) + TX、棉鈴威 (15) + TX、涕滅威 (16) + TX、涕滅虱威 (863) + TX、氯甲橋萘 (864) + TX、烯丙菊酯 (17) + TX、阿洛胺菌素 (替代名稱) [CCN] + TX、除害威 (866) + TX、氯氰菊酯 (202) + TX、 α -蛻皮激素 (替代名稱) [CCN] + TX、磷化鋁 (640) + TX、賽硫磷 (870) + TX、硫代醯胺 (872) + TX、滅害威 (873) + TX、胺吸磷 (875) + TX、胺吸磷草酸氫鹽 (875) + TX、雙甲脒 (24) + TX、新煙鹼 (877) + TX、乙基殺撲磷 (883) + TX、AVI 382 (化合物代碼) + TX、

AZ 60541 (化合物代碼) + TX、印楝素 (替代名稱) (41) + TX、甲基吡啶
 磷 (42) + TX、穀硫磷-乙基 (44) + TX、穀硫磷-甲基 (45) + TX、偶氮磷
 (889) + TX、蘇雲金芽孢桿菌 δ 內毒素類 (替代名稱) (52) + TX、六氟
 矽酸鋇 (替代名稱) [CCN] + TX、多硫化鋇 (IUPAC/化學文摘名稱) (892)
 + TX、熏菊酯 [CCN] + TX、Bayer 22/190 (研究代碼) (893) + TX、Bayer 22408
 (研究代碼) (894) + TX、噁蟲威 (58) + TX、丙硫克百威 (60) + TX、
 殺蟲磷 (66) + TX、 β -氟氯氰菊酯 (194) + TX、 β -氯氰菊酯 (203) + TX、
 聯苯菊酯 (76) + TX、生物烯丙菊酯 (78) + TX、生物烯丙菊酯 S-環戊烯
 基異構物 (替代名稱) (79) + TX、戊環苄呋菊酯 (bioethanomethrin) [CCN]
 + TX、生物氯菊酯 (908) + TX、除蟲菊酯 (80) + TX、二(2-氯乙基)醚 (IUPAC
 名稱) (909) + TX、雙三氟蟲脲 (83) + TX、硼砂 (86) + TX、溴滅菊酯
 (替代名稱) + TX、溴苯烯磷 (914) + TX、溴殺烯 (918) + TX、溴-DDT
 (替代名稱) [CCN] + TX、溴硫磷 (920) + TX、溴硫磷-乙基 (921) + TX、
 合殺威 (924) + TX、噻嗪酮 (99) + TX、畜蟲威 (926) + TX、脫甲基丁噻
 啉磷 (butathiofos) (927) + TX、丁酮威 (103) + TX、丁酯磷 (932) + TX、
 丁酮砒威 (104) + TX、丁基噻蟎靈 (替代名稱) + TX、硫線磷 (109) + TX、
 砷酸鈣 [CCN] + TX、氰化鈣 (444) + TX、多硫化鈣 (IUPAC 名稱) (111) +
 TX、毒殺芬 (941) + TX、氯滅殺威 (943) + TX、甲萘威 (115) + TX、克
 百威 (118) + TX、二硫化碳 (IUPAC/化學文摘名稱) (945) + TX、四氯化
 碳 (IUPAC 名稱) (946) + TX、三硫磷 (947) + TX、丁硫克百威 (119) +
 TX、殺螟丹 (123) + TX、殺螟丹鹽酸鹽 (123) + TX、西伐丁 (替代名稱)
 (725) + TX、冰片丹 (960) + TX、氯丹 (128) + TX、開蓬 (963) + TX、
 殺蟲脒 (964) + TX、殺蟲脒鹽酸鹽 (964) + TX、氯氧磷 (129) + TX、溴
 蟲腈 (130) + TX、毒蟲畏 (131) + TX、定蟲隆 (132) + TX、氯甲磷 (136)
 + TX、氯仿 [CCN] + TX、三氯硝基甲烷 (141) + TX、氯辛硫磷 (989) + TX、

滅蟲吡啶 (990) + TX、毒死蜱 (145) + TX、毒死蜱-甲基 (146) + TX、蟲蟊磷 (994) + TX、環蟲醯肼 (150) + TX、灰菊素 I (696) + TX、灰菊素 II (696) + TX、灰菊素類 (696) + TX、順式苳呋菊酯 (cis-resmethrin) (替代名稱) + TX、順式苳呋菊酯 (cismethrin) (80) + TX、功夫菊酯 (替代名稱) + TX、除線威 (999) + TX、氯氰碘柳胺 (替代名稱) [CCN] + TX、噻蟲胺 (165) + TX、乙醯亞砷酸銅 [CCN] + TX、砷酸銅 [CCN] + TX、油酸銅 [CCN] + TX、蠅毒磷 (174) + TX、畜蟲磷 (1006) + TX、克羅米通 (替代名稱) [CCN] + TX、巴毒磷 (1010) + TX、克蘆磷酯 (1011) + TX、冰晶石 (替代名稱) (177) + TX、CS 708 (研究代碼) (1012) + TX、苯腈磷 (1019) + TX、殺螟睛 (184) + TX、果蟲磷 (1020) + TX、環蟲菊酯 [CCN] + TX、乙氰菊酯 (188) + TX、氟氯氰菊酯 (193) + TX、三氯氟氰菊酯 (196) + TX、氯氰菊酯 (201) + TX、苯氰菊酯 (206) + TX、環丙馬秦 (209) + TX、畜蜚磷 (替代名稱) [CCN] + TX、d-檸檬烯 (替代名稱) [CCN] + TX、d-四甲菊酯 (替代名稱) (788) + TX、DAEP (1031) + TX、棉隆 (216) + TX、DDT (219) + TX、單甲基克百威 (decarbofuran) (1034) + TX、溴氰菊酯 (223) + TX、田樂磷 (1037) + TX、田樂磷-O (1037) + TX、田樂磷-S (1037) + TX、內吸磷 (1038) + TX、內吸磷-甲基 (224) + TX、內吸磷-O (1038) + TX、內吸磷-O-甲基 (224) + TX、內吸磷-S (1038) + TX、內吸磷-S-甲基 (224) + TX、內吸磷-S-甲基砒 (1039) + TX、丁醚脲 (226) + TX、氯亞胺硫磷 (1042) + TX、二胺磷 (1044) + TX、二嗪磷 (227) + TX、異氯磷 (1050) + TX、除線磷 (1051) + TX、敵敵畏 (236) + TX、二克磷 (dicliphos) (替代名稱) + TX、dicresyl (替代名稱) [CCN] + TX、百治磷 (243) + TX、地昔尼爾 (244) + TX、狄氏劑 (1070) + TX、二乙基 5-甲基吡啶-3-基磷酸酯 (IUPAC 名稱) (1076) + TX、除蟲脲 (250) + TX、二羥丙茶鹼 (dilor) (替代名稱) [CCN] + TX、四氟甲醚菊酯 [CCN] + TX、甲氟磷 (1081) + TX、地麥威 (1085) + TX、

樂果 (262) + TX、苄菊酯 (1083) + TX、甲基毒蟲畏 (265) + TX、敵蠅威 (1086) + TX、消蟊酚 (1089) + TX、消蟊酚-diclexine (1089) + TX、丙硝酚 (1093) + TX、戊硝酚 (1094) + TX、達諾殺 (1095) + TX、呋蟲胺 (271) + TX、苯蟲醚 (1099) + TX、蔬果磷 (1100) + TX、二氧威 (1101) + TX、敵惡磷 (1102) + TX、乙拌磷 (278) + TX、苯噻乙雙硫磷 (dithicrofos) (1108) + TX、DNOC (282) + TX、多拉克丁 (替代名稱) [CCN] + TX、DSP (1115) + TX、蛻皮激素 (替代名稱) [CCN] + TX、EI 1642 (研究代碼) (1118) + TX、依馬克丁 (291) + TX、苯甲酸依馬克丁 (291) + TX、EMPC (1120) + TX、烯炔菊酯 (292) + TX、硫丹 (294) + TX、因毒磷 (1121) + TX、異狄氏劑 (1122) + TX、EPBP (1123) + TX、EPN (297) + TX、保幼醚 (1124) + TX、依立諾克丁 (替代名稱) [CCN] + TX、高氰戊菊酯 (302) + TX、牛津郡丙硫磷 (etaphos) (替代名稱) [CCN] + TX、乙硫苯威 (308) + TX、乙硫磷 (309) + TX、乙蟲腈 (310) + TX、益硫磷-甲基 (1134) + TX、滅線磷 (312) + TX、甲酸乙酯 (IUPAC 名稱) [CCN] + TX、乙基-DDD (替代名稱) (1056) + TX、二溴化乙烯 (316) + TX、二氯化乙烯 (化學名稱) (1136) + TX、環氧乙烷 [CCN] + TX、醚菊酯 (319) + TX、乙嘧硫磷 (1142) + TX、EXD (1143) + TX、胺磺磷 (323) + TX、苯線磷 (326) + TX、抗蟊啞 (1147) + TX、皮蠅磷 (1148) + TX、苯硫威 (1149) + TX、芬氟司林 (1150) + TX、殺螟硫磷 (335) + TX、丁苯威 (336) + TX、嘧醯蟲胺 (fenoxacrim) (1153) + TX、苯氧威 (340) + TX、吡氯氰菊酯 (1155) + TX、甲氰菊酯 (342) + TX、吡蟊胺 (fenpyrad) (替代名稱) + TX、豐索磷 (1158) + TX、倍硫磷 (346) + TX、倍硫磷-乙基 [CCN] + TX、氰戊菊酯 (349) + TX、氟蟲腈 (354) + TX、氟啶蟲醯胺 (358) + TX、氟蟲醯胺 (CAS 登記號: 272451-65-7) + TX、氟氰戊菊酯標準品 (flucofuron) (1168) + TX、氟環脲 (366) + TX、氟氰戊菊酯 (367) + TX、聯氟蟊 (1169) + TX、嘧蟲胺 [CCN] + TX、氟蟲脲 (370)

+ TX、三氟醚菊酯(1171)+ TX、氟氯苯菊酯(372)+ TX、氟胺氰菊酯(1184)
 + TX、FMC 1137 (研究代碼)(1185)+ TX、地蟲磷(1191)+ TX、伐蟲脒
 (405)+ TX、伐蟲脒鹽酸鹽(405)+ TX、安硫磷(1192)+ TX、藻蟬威
 (formparanate)(1193)+ TX、丁苯硫磷(1194)+ TX、福司吡酯(1195)+
 TX、噻唑酮磷(408)+ TX、丁硫環磷(1196)+ TX、呋線威(412)+ TX、
 抗蟲菊(1200)+ TX、 γ -氯氟氰菊酯(197)+ TX、 γ -HCH(430)+ TX、
 雙胍鹽(422)+ TX、雙胍醋酸鹽(422)+ TX、GY-81 (研究代碼)(423)
 + TX、苧蟬醚(424)+ TX、氯蟲醯肼(425)+ TX、HCH(430)+ TX、HEOD
 (1070)+ TX、飛布達(1211)+ TX、庚烯磷(432)+ TX、速殺硫磷[CCN]
 + TX、氟鈴脒(439)+ TX、HHDN(864)+ TX、氟蟻肼(443)+ TX、氫
 氰酸(444)+ TX、烯蟲乙酯(445)+ TX、害奎威(hyquincarb)(1223)+ TX、
 吡蟲啉(458)+ TX、呋咪菊酯(460)+ TX、茚蟲威(465)+ TX、碘甲烷
 (IUPAC 名稱)(542)+ TX、IPSP(1229)+ TX、氯唑磷(1231)+ TX、碳
 氯靈(1232)+ TX、水胺硫磷(替代名稱)(473)+ TX、異艾氏劑(1235)
 + TX、異柳磷(1236)+ TX、移栽靈(1237)+ TX、異丙威(472)+ TX、
 O-(甲氧基-胺基硫代磷醯基)水楊酸異丙酯(IUPAC 名稱)(473)+ TX、稻
 瘟靈(474)+ TX、異拌磷(1244)+ TX、惡唑磷(480)+ TX、伊維菌素(替
 代名稱)[CCN]+ TX、茛菊素 I(696)+ TX、茛菊素 II(696)+ TX、
 碘硫磷(1248)+ TX、保幼激素 I(替代名稱)[CCN]+ TX、保幼激素 II(替
 代名稱)[CCN]+ TX、保幼激素 III(替代名稱)[CCN]+ TX、氯戊環(1249)
 + TX、烯蟲炔酯(484)+ TX、 λ -三氯氟氰菊酯(198)+ TX、砷酸鉛[CCN]
 + TX、雷皮菌素(CCN)+ TX、對溴磷(1250)+ TX、林旦(430)+ TX、
 丙嘧硫磷(lirimfos)(1251)+ TX、虱蟬脒(490)+ TX、噻唑磷(1253)+ TX、
 間異丙基苯基甲基胺基甲酸酯(IUPAC 名稱)(1014)+ TX、磷化鎂(IUPAC
 名稱)(640)+ TX、馬拉硫磷(492)+ TX、特蟬脒(1254)+ TX、疊氮磷

(1255) + TX、滅蚜磷 (502) + TX、四甲磷 (1258) + TX、滅蚜硫磷 (1260) + TX、地安磷 (1261) + TX、氯化亞汞 (513) + TX、倍硫磷亞砒 (mesulfenfos) (1263) + TX、氰氟蟲腓 (CCN) + TX、威百畝 (519) + TX、威百畝鉀 (替代名稱) (519) + TX、威百畝鈉 (519) + TX、蟲蟊畏 (1266) + TX、甲胺磷 (527) + TX、甲烷磺醯氟 (IUPAC/化學文摘名稱) (1268) + TX、殺撲磷 (529) + TX、滅蟲威 (530) + TX、殺蟲乙烯磷 (1273) + TX、滅多威 (531) + TX、烯蟲酯 (532) + TX、甲啞丁 (1276) + TX、甲醚菊酯 (替代名稱) (533) + TX、甲氧滴滴涕 (534) + TX、甲氧苯醯 (535) + TX、甲基溴 (537) + TX、異硫氰酸甲酯 (543) + TX、甲基氯仿 (替代名稱) [CCN] + TX、二氯甲烷 [CCN] + TX、甲氧苄氟菊酯 [CCN] + TX、速滅威 (550) + TX、惡蟲酮 (1288) + TX、速滅磷 (556) + TX、茲克威 (1290) + TX、密滅汀 (557) + TX、殺蟎菌素脲 (替代名稱) [CCN] + TX、丙胺氟磷 (1293) + TX、滅蟻靈 (1294) + TX、久效磷 (561) + TX、茂硫磷 (1300) + TX、莫昔克丁 (替代名稱) [CCN] + TX、萘酞磷 (替代名稱) [CCN] + TX、二溴磷 (567) + TX、萘 (IUPAC/化學文摘名稱) (1303) + TX、NC-170 (研究代碼) (1306) + TX、NC-184 (化合物代碼) + TX、煙鹼 (578) + TX、硫酸煙鹼 (578) + TX、氟蟻靈 (1309) + TX、烯啶蟲胺 (579) + TX、硝乙脲噻唑 (nithiazine) (1311) + TX、戊氰威 (1313) + TX、戊氰威 1:1 氯化鋅錯合物 (1313) + TX、NNI-0101 (化合物代碼) + TX、NNI-0250 (化合物代碼) + TX、降煙鹼 (傳統名稱) (1319) + TX、雙苯氟脲 (585) + TX、多氟脲 (586) + TX、O-5-二氯-4-碘苯基 O-乙基乙基硫代磷酸酯 (IUPAC 名稱) (1057) + TX、O,O-二乙基 O-4-甲基-2-側氧-2H-吡啶-7-基硫代磷酸酯 (IUPAC 名稱) (1074) + TX、O,O-二乙基 O-6-甲基-2-丙基嘧啶-4-基硫代磷酸酯 (IUPAC 名稱) (1075) + TX、O,O,O',O'-四丙基二硫代焦磷酸酯 (IUPAC 名稱) (1424) + TX、油酸 (IUPAC 名稱) (593) + TX、氧化樂果 (594) + TX、殺線威 (602) + TX、砒吸磷-

甲基 (609) + TX、異亞砒磷 (1324) + TX、砒拌磷 (1325) + TX、pp'-DDT
 (219) + TX、對-二氯苯[CCN] + TX、對硫磷 (615) + TX、對硫磷-甲基 (616)
 + TX、氟幼脲 (替代名稱) [CCN] + TX、五氯苯酚 (623) + TX、月桂酸五
 氯苯基酯 (IUPAC 名稱) (623) + TX、氯菊酯 (626) + TX、石油油料類 (替
 代名稱) (628) + TX、PH 60-38 (研究代碼) (1328) + TX、芬硫磷 (1330)
 + TX、苯醚菊酯 (630) + TX、稻豐散 (631) + TX、甲拌磷 (636) + TX、
 伏殺硫磷 (637) + TX、硫環磷 (1338) + TX、亞胺硫磷 (638) + TX、對氯
 硫磷 (1339) + TX、磷胺 (639) + TX、磷 (IUPAC 名稱) (640) + TX、辛
 硫磷 (642) + TX、辛硫磷-甲基 (1340) + TX、甲胺嘧磷 (pirimethaphos) (1344)
 + TX、抗蚜威 (651) + TX、蟲蟊磷-乙基 (1345) + TX、蟲蟊磷-甲基 (652)
 + TX、聚氯二環戊二烯異構物類 (IUPAC 名稱) (1346) + TX、聚氯萘類 (傳
 統名稱) (1347) + TX、亞砒酸鉀[CCN] + TX、硫氰酸鉀[CCN] + TX、丙炔
 菊酯 (655) + TX、早熟素 I (替代名稱) [CCN] + TX、早熟素 II (替代名稱)
 [CCN] + TX、早熟素 III (替代名稱) [CCN] + TX、乙醯嘧啶磷 (primidophos)
 (1349) + TX、丙溴磷 (662) + TX、丙氟菊酯[CCN] + TX、蜚虱威 (1354)
 + TX、猛殺威 (1355) + TX、丙蟲磷 (1356) + TX、胺丙畏 (673) + TX、
 殘殺威 (678) + TX、乙噻唑磷 (1360) + TX、丙硫磷 (686) + TX、發硫磷
 (1362) + TX、丙苯炔菊酯 (protrifenbute) [CCN] + TX、吡蚜酮 (688) + TX、
 吡唑硫磷 (689) + TX、定菌磷 (693) + TX、苜呋菊酯 (pyresmethrin) (1367)
 + TX、除蟲菊酯 I (696) + TX、除蟲菊酯 II (696) + TX、除蟲菊酯類 (696)
 + TX、噻蟊靈 (pyridaben) (699) + TX、啖蟲丙醚 (700) + TX、啖吡硫磷
 (pyridaphenthion) (701) + TX、啖蟊醚 (706) + TX、啖硫磷 (1370) + TX、
 吡丙醚 (708) + TX、苦木提取物 (quassia) (替代名稱) [CCN] + TX、啖硫
 磷 (quinalphos) (711) + TX、啖硫磷-甲基 (1376) + TX、畜寧磷 (1380) +
 TX、啖硫磷 (quintiofos) (1381) + TX、R-1492 (研究代碼) (1382) + TX、

雷複尼特（替代名稱）[CCN] + TX、苜呋菊酯（719）+ TX、魚藤酮（722）+ TX、RU 15525（研究代碼）（723）+ TX、RU 25475（研究代碼）（1386）+ TX、尼亞那（ryania）（替代名稱）（1387）+ TX、利阿諾定（傳統名稱）（1387）+ TX、沙巴藜蘆（替代名稱）（725）+ TX、八甲磷（1389）+ TX、硫線磷（替代名稱）+ TX、塞拉菌素（替代名稱）[CCN] + TX、SI-0009（化合物代碼）+ TX、SI-0205（化合物代碼）+ TX、SI-0404（化合物代碼）+ TX、SI-0405（化合物代碼）+ TX、氟矽菊酯（728）+ TX、SN 72129（研究代碼）（1397）+ TX、亞砷酸鈉[CCN] + TX、氰化鈉（444）+ TX、氟化鈉（IUPAC/化學文摘名稱）（1399）+ TX、六氟矽酸鈉（1400）+ TX、五氯酚鈉（623）+ TX、硒酸鈉（IUPAC 名稱）（1401）+ TX、硫氰酸鈉[CCN] + TX、蘇硫磷（1402）+ TX、多殺菌素（737）+ TX、螺甲蟎酯（739）+ TX、螺蟲乙酯（CCN）+ TX、磺苯醚隆（sulcofuron）（746）+ TX、磺苯醚隆鈉（sulcofuron-sodium）（746）+ TX、氟蟲胺（750）+ TX、治螟磷（753）+ TX、磺醯氟（756）+ TX、硫丙磷（1408）+ TX、焦油類（替代名稱）（758）+ TX、t-氟胺氰菊酯（398）+ TX、噻蟎威（1412）+ TX、TDE（1414）+ TX、蟲醯肼（762）+ TX、吡蟎胺（763）+ TX、丁基嘧啶磷（764）+ TX、伏蟲脲（768）+ TX、七氟菊酯（769）+ TX、雙硫磷（770）+ TX、TEPP（1417）+ TX、環戊烯丙菊酯（1418）+ TX、三級丁威（terbam）（替代名稱）+ TX、特丁硫磷（773）+ TX、四氯乙烷[CCN] + TX、殺蟲畏（777）+ TX、四甲菊酯（787）+ TX、 θ -氯氰菊酯（204）+ TX、噻蟲啉（791）+ TX、噻菲農（thiafenox）（替代名稱）+ TX、噻蟲嗪（792）+ TX、苯噻乙硫磷（thicrofos）（1428）+ TX、克蟲威（1431）+ TX、殺蟲環（798）+ TX、殺蟲環草酸氫鹽（798）+ TX、硫雙威（799）+ TX、久效威（800）+ TX、甲基乙拌磷（801）+ TX、蟲線磷（1434）+ TX、殺蟲單（thiosultap）（803）+ TX、殺蟲雙（thiosultap-sodium）（803）+ TX、蘇雲金素（替代名稱）[CCN] + TX、啞蟲醯胺（809）+ TX、四溴菊

酯(812)+TX、四氟苯菊酯(813)+TX、反氯菊酯(transpermethrin)(1440)+TX、威菌磷(1441)+TX、啞蚜威(818)+TX、三啞磷(820)+TX、啞呀威(替代名稱)+TX、敵百蟲(824)+TX、三氯甲基對硫磷(trichlormetaphos)-3(替代名稱)[CCN]+TX、毒壤磷(1452)+TX、三氯丙氧磷(1455)+TX、殺鈴脲(835)+TX、混殺威(840)+TX、烯蟲硫酯(1459)+TX、蚜滅磷(847)+TX、氟吡啶蟲(vaniliprole)[CCN]+TX、藜蘆定(替代名稱)(725)+TX、藜蘆鹼(替代名稱)(725)+TX、XMC(853)+TX、滅殺威(854)+TX、YI-5302(化合物代碼)+TX、ζ-氯氰菊酯(205)+TX、zetamethrin(替代名稱)+TX、磷化鋅(640)+TX、丙硫惡啞磷(zolapropos)(1469)、以及 ZXI 8901(研究代碼)(858)+TX、氰蟲醯胺[736994-63-19]+TX、氰蟲醯胺[500008-45-7]+TX、啞蟎氰(cyenopyrafen)[560121-52-0]+TX、丁氟蟎酯[400882-07-7]+TX、氟蟲吡啶(pyrifluquinazon)[337458-27-2]+TX、乙基多殺菌素(spinetoram)[187166-40-1 + 187166-15-0]+TX、螺蟲乙酯[203313-25-1]+TX、磺蟲啞(sulfoxaflor)[946578-00-3]+TX、丁蟲腈(flufiprole)[704886-18-0]+TX、氯氟醚菊酯[915288-13-0]+TX、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)[84937-88-2]+TX、

殺軟體動物劑，該殺軟體動物劑選自由以下物質組成的組：二(三丁基錫)氧化物(IUPAC 名稱)(913)+TX、溴乙醯胺[CCN]+TX、砷酸鈣[CCN]+TX、除線威(cloethocarb)(999)+TX、乙醯亞砷酸銅[CCN]+TX、硫酸銅(172)+TX、三苯錫(347)+TX、磷酸鐵(IUPAC 名稱)(352)+TX、四聚乙醛(518)+TX、滅蟲威(530)+TX、氯硝柳胺(576)+TX、氯硝柳胺乙醇胺鹽(576)+TX、五氯酚(623)+TX、五氯苯氧化鈉(623)+TX、噁蟎威(tazimcarb)(1412)+TX、硫雙威(799)+TX、三丁基氧化錫(913)+TX、殺螺味啉(trifenmorph)(1454)+TX、混殺威(trimethacarb)(840)+TX、乙酸三苯基錫(IUPAC 名稱)(347)和三苯基氫氧化錫(IUPAC 名

稱)(347)+TX、吡啶醇(pyriprole)[394730-71-3]+TX,

殺線蟲劑,該殺線蟲劑選自由以下物質組成的組:AKD-3088(化合物代碼)+TX、1,2-二溴-3-氯丙烷(IUPAC/化學文摘名)(1045)+TX、1,2-二氯丙烷(IUPAC/化學文摘名)(1062)+TX、1,2-二氯丙烷與1,3-二氯丙烯(IUPAC名稱)(1063)+TX、1,3-二氯丙烯(233)+TX、3,4-二氯四氫噻吩1,1-二氧化物(IUPAC/化學文摘名)(1065)+TX、3-(4-氯苯基)-5-甲基玫瑰寧(IUPAC名稱)(980)+TX、5-甲基-6-硫代-1,3,5-噻二吡嗪-3-基乙酸(IUPAC名稱)(1286)+TX、6-異戊烯基氨基嘌呤(替代名稱)(210)+TX、阿巴丁(1)+TX、乙醯蟲脞[CCN]+TX、棉鈴威(15)+TX、涕滅威(aldicarb)(16)+TX、涕滅虱威(aldoxycarb)(863)+TX、AZ 60541(化合物代碼)+TX、benclotiaz[CCN]+TX、苯菌靈(62)+TX、丁基噻蟎酮(butylpyridaben)(替代名稱)+TX、硫線磷(cadusafos)(109)+TX、克百威(carbofuran)(118)+TX、二硫化碳(945)+TX、丁硫克百威(119)+TX、氯化苦(141)+TX、毒死蜱(145)+TX、除線威(cloethocarb)(999)+TX、細胞分裂素(cytokinins)(替代名稱)(210)+TX、棉隆(216)+TX、DBCP(1045)+TX、DCIP(218)+TX、除線特(diamidafos)(1044)+TX、除線磷(dichlofenthion)(1051)+TX、二克磷(dicliphos)(替代名稱)+TX、樂果(262)+TX、多拉克丁(替代名稱)[CCN]+TX、依馬克丁(替代名稱)[CCN]+TX、依馬克丁苯甲酸酯(291)+TX、依立諾克丁(替代名稱)[CCN]+TX、滅線磷(312)+TX、二溴乙烷(316)+TX、苯線磷(fenamiphos)(326)+TX、吡蟎胺(替代名稱)+TX、豐索磷(fenpyrad)(1158)+TX、噻唑磷(fosthiazate)(408)+TX、丁硫環磷(fosthietan)(1196)+TX、糠醛(替代名稱)[CCN]+TX、GY-81(研究代碼)(423)+TX、速殺硫磷(heterophos)[CCN]+TX、碘甲烷(IUPAC名稱)(542)+TX、isamidofos(1230)+TX、氯唑磷(isazofos)(1231)+TX、伊維菌素(替代名稱)[CCN]+TX、激動素(替代名稱)[CCN]

+ TX、甲基滅蚜磷 (mecarphon) (1258) + TX、威百畝 (519) + TX、威百畝鉀鹽 (替代名稱) (519) + TX、威百畝鈉鹽 (519) + TX、甲基溴 (537) + TX、異硫氰酸甲酯 (543) + TX、殺蟎菌素肟 (milbemycin oxime) (替代名稱) [CCN] + TX、莫昔克丁 (別名) [CCN] + TX、疣孢漆斑菌 (*Myrothecium verrucaria*) 組分 (替代名稱) (565) + TX、NC-184 (化合物代碼) + TX、殺線威 (602) + TX、甲拌磷 (636) + TX、磷胺 (639) + TX、磷蟲威 (phosphocarb) [CCN] + TX、硫線磷 (sebufos) (替代名稱) + TX、塞拉菌素 (selamectin) (替代名稱) [CCN] + TX、多殺菌素 (737) + TX、三級丁威 (terbam) (替代名稱) + TX、特丁磷 (terbufos) (773) + TX、四氯嘧吩 (IUPAC/化學文摘名) (1422) + TX、噻菲農 (替代名稱) + TX、蟲線磷 (thionazin) (1434) + TX、三唑磷 (triazophos) (820) + TX、triazuron (替代名稱) + TX、二甲苯酚 [CCN] + TX、YI-5302 (化合物代碼) 和玉米素 (替代名稱) (210) + TX、fluensulfone [318290-98-1] + TX，

硝化作用抑制劑，該硝化作用抑制劑選自由以下物質組成的組：乙基黃原酸鉀 [CCN] 以及氯吡啶 (nitrapyrin) (580) + TX，

植物活化劑，該植物活化劑選自由以下物質組成的組：噻二唑素 (acibenzolar) (6) + TX、噻二唑素-S-甲基 (6) + TX、烯丙苯噻唑 (probenazole) (658) 和大虎杖 (*Reynoutria sachalinensis*) 提取物 (替代名稱) (720) + TX，

殺鼠劑，該殺鼠劑選自由以下物質組成的組：2-異戊醯二氫茛-1,3-二酮 (IUPAC 名稱) (1246) + TX、4-(喹啉-2-基胺基)苯磺醯胺 (IUPAC 名稱) (748) + TX、 α -氯代醇 [CCN] + TX、磷化鋁 (640) + TX、安妥 (880) + TX、三氧化二砷 (882) + TX、碳酸鋇 (891) + TX、雙鼠脲 (912) + TX、溴鼠隆 (89) + TX、溴敵隆 (91) + TX、溴鼠胺 (92) + TX、氰化鈣 (444) + TX、氮醛糖 (127) + TX、氯鼠酮 (140) + TX、維生素 D3 (替代名稱) (850) + TX、氯滅鼠靈 (1004) + TX、克滅鼠 (1005) + TX、殺鼠萘 (175) + TX、

殺鼠嘧啶 (1009) + TX、鼠得克 (246) + TX、噻鼠靈 (249) + TX、敵鼠鈉 (273) + TX、維生素 D2 (301) + TX、氟鼠靈 (357) + TX、氟乙醯胺 (379) + TX、鼠樸定 (1183) + TX、鹽酸鼠樸定 (1183) + TX、 γ -HCH (430) + TX、HCH (430) + TX、氫氰酸 (444) + TX、碘甲烷 (IUPAC 名稱) (542) + TX、林旦 (430) + TX、磷化鎂 (IUPAC 名稱) (640) + TX、甲基溴 (537) + TX、鼠特靈 (1318) + TX、毒鼠磷 (1336) + TX、磷 (IUPAC 名稱) (640) + TX、磷[CCN] + TX、殺鼠酮 (1341) + TX、亞砷酸鉀 [CCN] + TX、滅鼠優 (1371) + TX、海蔥糖苷 (1390) + TX、亞砷酸鈉 [CCN] + TX、氰化鈉 (444) + TX、氟乙酸鈉 (735) + TX、士的寧 (745) + TX、硫酸鉍 [CCN] + TX、殺鼠靈 (851) 以及磷化鋅 (640) + TX，

增效劑，該增效劑選自由以下物質組成的組：2-(2-丁氧基乙氧基)乙基胡椒基酯 (IUPAC 名稱) (934) + TX、5-(1,3-苯并二氧雜環戊烯-5-基)-3-己基環己-2-烯酮 (IUPAC 名稱) (903) + TX、具有橙花三級醇的茵綠烯醇 (替代名稱) (324) + TX、MB-599 (研究代碼) (498) + TX、MGK 264 (研究代碼) (296) + TX、增效醚 (piperonyl butoxide) (649) + TX、增效醛 (piprotal) (1343) + TX、增效酯 (propyl isomer) (1358) + TX、S421 (研究代碼) (724) + TX、增效散 (sesamex) (1393) + TX、sesasmolin (1394) 和亞砷 (1406) + TX，

動物驅避劑，該動物驅避劑選自由以下物質組成的組：蔥醌 (32) + TX、氯醛糖 (127) + TX、環烷酸銅 [CCN] + TX、王銅 (171) + TX、二嗪磷 (227) + TX、二環戊二烯 (化學名稱) (1069) + TX、雙胍鹽 (guazatine) (422) + TX、雙胍醋酸鹽 (422) + TX、滅蟲威 (530) + TX、吡啶-4-胺 (IUPAC 名稱) (23) + TX、塞侖 (804) + TX、混殺威 (trimethacarb) (840) + TX、環烷酸鋅[CCN]和福美鋅 (856) + TX，

殺病毒劑，該殺病毒劑選自由以下物質組成的組：衣馬寧 (imanin) (替

代名稱) [CCN] 和利巴韋林 (替代名稱) [CCN] + TX,

創傷保護劑, 該創傷保護劑選自由以下物質組成的組: 氧化汞 (512) + TX、辛噻酮 (octhilinone) (590) 和甲基硫菌靈 (802) + TX,

以及生物活性的化合物, 該化合物選自由以下物質組成的組: 阿紫康唑 (60207-31-0) + TX、聯苯三唑醇 [70585-36-3] + TX、糠菌唑 [116255-48-2] + TX、環唑醇 [94361-06-5] + TX、苯醚甲環唑 [119446-68-3] + TX、烯唑醇 [83657-24-3] + TX、氟環唑 [106325-08-0] + TX、腈苯唑 [114369-43-6] + TX、氟啞唑 [136426-54-5] + TX、氟矽唑 [85509-19-9] + TX、粉唑醇 [76674-21-0] + TX、己唑醇 [79983-71-4] + TX、抑黴唑 [35554-44-0] + TX、亞胺唑 [86598-92-7] + TX、種菌唑 [125225-28-7] + TX、葉菌唑 [125116-23-6] + TX、腈菌唑 [88671-89-0] + TX、稻瘟酯 [101903-30-4] + TX、戊菌唑 [66246-88-6] + TX、丙硫菌唑 [178928-70-6] + TX、啞斑肟 (pyrifenox) [88283-41-4] + TX、丙氯靈 [67747-09-5] + TX、丙環唑 [60207-90-1] + TX、矽氟唑 (simeconazole) [149508-90-7] + TX、戊唑醇 [107534-96-3] + TX、氟醚唑 [112281-77-3] + TX、三唑酮 [43121-43-3] + TX、三唑酮 [55219-65-3] + TX、氟菌唑 [99387-89-0] + TX、滅菌唑 [131983-72-7] + TX、三環苯嘧啶醇 [12771-68-5] + TX、氯苯嘧啶醇 [60168-88-9] + TX、氟氯苯嘧啶醇 [63284-71-9] + TX、乙嘧啶磺酸酯 (bupirimate) [41483-43-6] + TX、甲菌定 (dimethirimol) [5221-53-4] + TX、乙菌定 (ethirimol) [23947-60-6] + TX、十二環咪啉 (dodemorph) [1593-77-7] + TX、苯鏽啞 (fenpropidine) [67306-00-7] + TX、丁苯咪啉 (fenpropimorph) [67564-91-4] + TX、螺環菌胺 [118134-30-8] + TX、十三咪啉 (tridemorph) [81412-43-3] + TX、嘧菌環胺 [121552-61-2] + TX、嘧菌胺 [110235-47-7] + TX、嘧黴胺 (pyrimethanil) [53112-28-0] + TX、拌種咯 [74738-17-3] + TX、咯菌腈 (fludioxonil) [131341-86-1] + TX、苯霜靈 (benalaxyl) [71626-11-4] + TX、呋霜靈 (furalaxyl) [57646-30-7] + TX、甲霜靈 [57837-19-1] + TX、R-

甲霜靈 [70630-17-0] + TX、呋噻胺 [58810-48-3] + TX、惡霜靈 (Oxadixyl) [77732-09-3] + TX、苯菌靈 [17804-35-2] + TX、多菌靈 [10605-21-7] + TX、咪菌威 (debacarb) [62732-91-6] + TX、麥穗寧 [3878-19-1] + TX、噻苯達唑 [148-79-8] + TX、乙菌利 (chlozolate) [84332-86-5] + TX、菌核利 (dichlozoline) [24201-58-9] + TX、異菌脲 (Iprodione) [36734-19-7] + TX、甲菌利 (myclozoline) [54864-61-8] + TX、腐黴利 (procymidone) [32809-16-8] + TX、乙烯菌核利 (vinclozoline) [50471-44-8] + TX、啞噻菌胺 (boscalid) [188425-85-6] + TX、萎鏽靈 [5234-68-4] + TX、甲呋噻苯胺 [24691-80-3] + TX、氟噻胺 (Flutolanil) [66332-96-5] + TX、滅鏽胺 [55814-41-0] + TX、氧化萎鏽靈 [5259-88-1] + TX、吡噻菌胺 (penthioylrad) [183675-82-3] + TX、噻呋菌胺 [130000-40-7] + TX、雙胍鹽 [108173-90-6] + TX、多果定 (dodine) [2439-10-3] [112-65-2] (游離鹼) + TX、雙胍辛胺 (iminooctadine) [13516-27-3] + TX、嘧菌酯 [131860-33-8] + TX、醚菌胺 [149961-52-4] + TX、烯肟菌酯 {Proc. BCPC, Int. Congr., Glasgow. 2003, 1, 93} + TX、氟嘧菌酯 [361377-29-9] + TX 甲基醚菌酯 [143390-89-0] + TX、苯氧菌胺 [133408-50-1] + TX、肟菌酯 [141517-21-7] + TX、肟醚菌胺 [248593-16-0] + TX、啞氧菌酯 [117428-22-5] + TX、啞菌胺酯 [175013-18-0] + TX、福美鐵 [14484-64-1] + TX、代森錳鋅 [8018-01-7] + TX、代森錳 [12427-38-2] + TX、代森聯 [9006-42-2] + TX、甲代森鋅 (propineb) [12071-83-9] + TX、塞侖 [137-26-8] + TX、代森鋅 [12122-67-7] + TX、福美鋅 [137-30-4] + TX、敵菌丹 (captafol) [2425-06-1] + TX、克菌丹 [133-06-2] + TX、苯氟磺胺 [1085-98-9] + TX、啞啞草 (fluoroimide) [41205-21-4] + TX、滅菌丹 [133-07-3] + TX、甲苯氟磺胺 [731-27-1] + TX、波爾多 (bordeaux) 混合物 [8011-63-0] + TX、氫氧化銅 (copperhydroxid) [20427-59-2] + TX、氯化銅 (copperoxychlorid) [1332-40-7] + TX、硫酸銅 (coppersulfat) [7758-98-7] + TX、氧化銅 (copperoxid) [1317-39-1] + TX、代森錳銅 (mancopper) [53988-93-5] + TX、啞啞銅

(oxine-copper) [10380-28-6] + TX、敵蟎普 (dinocap) [131-72-6] + TX、酞菌酯 (nitrothal-isopropyl) [10552-74-6] + TX、克瘟散 [17109-49-8] + TX、異稻瘟淨 (iprobenphos) [26087-47-8] + TX、稻瘟靈 (isoprothiolane) [50512-35-1] + TX、氯瘟磷 (phosdiphen) [36519-00-3] + TX、克菌磷 (pyrazophos) [13457-18-6] + TX、甲基托氯磷 (tolclofos-methyl) [57018-04-9] + TX、苯并噻二唑 (acibenzolar-S-methyl) [135158-54-2] + TX、敵菌靈 [101-05-3] + TX、苯噻菌胺 [413615-35-7] + TX、滅瘟素 (blasticidin) -S [2079-00-7] + TX、滅蟎猛 (chinomethionat) [2439-01-2] + TX、地茂散 (chloroneb) [2675-77-6] + TX、百菌清 [1897-45-6] + TX、環氟菌胺 [180409-60-3] + TX、霜脲氰 [57966-95-7] + TX、二氯萘醌 (dichlone) [117-80-6] + TX、雙氯氰菌胺 (diclocymet) [139920-32-4] + TX、噻菌酮 (diclomezine) [62865-36-5] + TX、氯硝胺 (dicloran) [99-30-9] + TX、乙黴威 (diethofencarb) [87130-20-9] + TX、烯醯肟末啉 (dimetho-morph) [110488-70-5] + TX、SYP-LI90 (Flumorph) [211867-47-9] + TX、二噻農 (dithianon) [3347-22-6] + TX、噻唑菌胺 (ethaboxam) [162650-77-3] + TX、土菌靈 (etridiazole) [2593-15-9] + TX、惡唑菌酮 [131807-57-3] + TX、咪唑菌酮 (fenamidone) [161326-34-7] + TX、稻瘟醯胺 (Fenoxanil) [115852-48-7] + TX、三苯錫 (fentin) [668-34-8] + TX、嘧菌腙 (ferimzone) [89269-64-7] + TX、氟啶胺 (fluazinam) [79622-59-6] + TX、氟吡菌胺 (fluopicolide) [239110-15-7] + TX、磺菌胺 (flusulfamide) [106917-52-6] + TX、環醯菌胺 [126833-17-8] + TX、福賽得 (fosetyl-aluminium) [39148-24-8] + TX、惡黴靈 (hymexazol) [10004-44-1] + TX、丙森鋅 [140923-17-7] + TX、IKF-916 (賽座滅 (Cyazofamid)) [120116-88-3] + TX、春雷黴素 (kasugamycin) [6980-18-3] + TX、磺菌威 (methasulfocarb) [66952-49-6] + TX、苯菌酮 [220899-03-6] + TX、戊菌隆 (pencycuron) [66063-05-6] + TX、苯酞 [27355-22-2] + TX、多氧黴素 (polyoxins) [11113-80-7] + TX、噻菌靈 (probenazole) [27605-76-1] + TX、

百維威(propamocarb)[25606-41-1] + TX、碘喹唑酮(proquinazid)[189278-12-4] + TX、樂喹酮(pyroquilon)[57369-32-1] + TX、喹氧靈[124495-18-7] + TX、五氯硝苯[82-68-8] + TX、硫[7704-34-9] + TX、噻醯菌胺[223580-51-6] + TX、咪唑嗪(triazoxide)[72459-58-6] + TX、三環唑[41814-78-2] + TX、噻胺靈[26644-46-2] + TX、有效黴素[37248-47-8] + TX、苯醯菌胺(zoxamide)(RH7281)[156052-68-5] + TX、雙炔醯菌胺(mandipropamid)[374726-62-2] + TX、吡蚜酮(isopyrazam)[881685-58-1] + TX、sedaxane[874967-67-6] + TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸(9-二氯亞甲基-1,2,3,4-四氫-1,4-甲橋-萘-5-基)-醯胺(在WO 2007/048556中揭露的) + TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸[2-(2,4-二氯苯基)-2-甲氧基-1-甲基-乙基]-醯胺(在中WO 2008/148570揭露的) + TX、1-[4-[4-[(5S)5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基]哌啶-1-基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮 + TX、1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基]哌啶-1-基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮[1003318-67-9]，兩者均在WO 2010/123791、WO 2008/013925、WO 2008/013622和WO 2011/051243中第20頁揭露) + TX、以及3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸(3',4',5'-三氟-二苯-2-基)-醯胺(揭露在WO 2006/087343中) + TX。

在活性成分之後的方括號中的參考例如[3878-19-1]係指化學文摘的登記號。以上描述的混合搭配物係已知的。當活性成分包括在“殺有害生物劑手冊(The Pesticide Manual)”[殺有害生物劑手冊-全球概覽(The Pesticide Manual - A World Compendium)；第13版；編著：C. D. S. Tomlin；英國農作物保護委員會(The Pesticide Manual - A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C. D. S. Tomlin; The British Crop Protection Council)]中時，它們在上文對於特定化合物在圓括號內給定的條目編號之下描述於該手冊中；例如，化合物“阿巴丁”在條目編號(1)之下描述。當以上對具體的化合物加入

“[CCN]”時，所討論的化合物包括在“殺有害生物通用名綱要（Compendium of Pesticide Common Names）”中，該綱要在互聯網上可得：[A. Wood；農藥通用名綱要，版權©1995-2004]；例如化合物“乙醯蟲腈”在互聯網址 <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html> 下進行了描述。

上述的活性成分中大部分在上文是藉由所謂的“通用名”、相關的“ISO 通用名”或在個別情況下使用的另一個“通用名”來提及。如果其名稱不是“通用名”，則對於特定化合物在圓括號內給出了作為代替而使用的該名稱的性質；在這種情況下，使用 IUPAC 名稱、IUPAC/化學文摘名稱、“化學名稱”、“傳統名稱”、“化合物名稱”、或“研究代碼”，或者如果既沒有使用該等名稱之一，也沒有使用“通用名”，則使用的是“替代名稱”。“CAS 登記號”表示化學文摘登記號。

在每種組合中任何兩種成分的質量比被選擇為給予所希望的例如協同作用。總體上，該質量比將根據具體的成分以及在該組合中存在多少成分而進行變化。總體上，在本發明的任何組合中兩種成分之間的質量比彼此獨立地是從 100 : 1 至 1 : 100，包括從 99 : 1、98 : 2、97 : 3、96 : 4、95 : 5、94 : 6、93 : 7、92 : 8、91 : 9、90 : 10、89 : 11、88 : 12、87 : 13、86 : 14、85 : 15、84 : 16、83 : 17、82 : 18、81 : 19、80 : 20、79 : 21、78 : 22、77 : 23、76 : 24、75 : 25、74 : 26、73 : 27、72 : 28、71 : 29、70 : 30、69 : 31、68 : 32、67 : 33、66 : 34、65 : 45、64 : 46、63 : 47、62 : 48、61 : 49、60 : 40、59 : 41、58 : 42、57 : 43、56 : 44、55 : 45、54 : 46、53 : 47、52 : 48、51 : 49、50 : 50、49 : 51、48 : 52、47 : 53、46 : 54、45 : 55、44 : 56、43 : 57、42 : 58、41 : 59、40 : 60、39 : 61、38 : 62、37 : 63、36 : 64、35 : 65、34 : 66、33 : 67、32 : 68、31 : 69、30 : 70、29 : 71、28 : 72、27 : 73、26 : 74、25 : 75、24 : 76、23 : 77、22 : 78、21 : 79、20 : 80、19 : 81、18 : 82、17 : 83、16 : 84、15 : 85、14 : 86、13 : 87、12 : 88、11 : 89、10 : 90、9 : 91、8 : 92、7 : 93、6 : 94、5 : 95、4 : 96、3 :

97、2 : 98 至 1 : 99。本發明的任何兩種組分之間的較佳的質量比係從 75 : 1 至 1 : 75、更佳的是 50 : 1 至 1.50、尤其是 25 : 1 至 1 : 25，有利地是 10 : 1 指 1 : 10，如 5 : 1 至 1 : 5，例如 1 : 3 至 3 : 1。該等混合比率被理解為包括，一方面係按質量計，並且還有另一方面係莫耳比。

用於本發明的化合物及其組合物的施用方法的實例，即控制農業中的有害生物/真菌的方法，如噴霧、霧化，撒粉，刷塗，拌種，撒播或澆灌-它們被選擇以適於當時環境的預期目的。

在農業中的一種較佳的施用方法係施用至該等植物的葉（葉施用），可能的是選擇施用的頻率和量率以符合所討論的有害生物/真菌的侵染風險。可替代地，該活性成分可以經由根系統（內吸作用）到達植物，這係藉由施用該化合物至該等植物的場所，例如，藉由將該化合物的液體組合物施用至土壤中（藉由浸透），或藉由將固體形式的該化合物以顆粒的形式施用到土壤（土壤施用）來實現的。在水稻植物的情況下，這樣的顆粒可以被計量地加入淹水的稻田中。

每公頃典型的施用比率一般是每公頃 1 g 至 2000 g 的活性成分，特別是 10 g/ha 至 1000 g/ha，較佳的是 10 g/ha 至 600 g/ha，例如 50 g/ha 至 300 g/ha。

本發明的該等化合物及其組合物還適合於植物繁殖材料的保護（例如種子，像果實、塊莖或籽粒，或者苗圃植物）對抗上述類型的有害生物。可以用該化合物在種植前對該繁殖材料進行處理，例如可以在播種前對種子進行處理。可替代地，該化合物可以施用至種子籽粒（包衣），這是藉由將籽粒浸漬入液體組合物中或藉由施塗固體組合物層實現的。當該繁殖材料被種植在施用地點時，還可能例如在條播期間將該等組合物施入種子犁溝。該等用於植物繁殖材料的處理方法和因此處理的植物繁殖材料係本發明另外的主題。典型的處理比率將取決於有待控制的植物以及有害生物/真菌，通常在每 100 kg 種子 1 克至 200 克之間，較佳的是在每 100 kg 種子 5

克至 150 克之間，例如在每 100 kg 種子 10 克至 100 克之間。

術語種子包括所有種類的種子以及植物繁殖體，包括但並不限於真正的種子，種子塊，吸盤，穀粒，鱗莖，果實，塊莖，穀物，根莖，插條，切割枝條以及類似物並且在較佳的實施方式中是指真正的種子。

本發明還包括經具有式 I 的化合物包衣或處理或含有具有式 I 之化合物的種子。儘管成分的更多或更少的部分可以滲透到該種子材料中，這取決於施用的方法，術語“包衣或處理和/或含有”通常表示在施用的時候，在大多數情況下，該活性成分在該種子的表面。當所述種子產物（再）種植時，它可以吸收該活性成分。在實施方式中，本發明使得其上黏附有具有式 (I) 之化合物的植物繁殖材料可得。此外，由此可得包含用具有式 (I) 之化合物處理過的植物繁殖材料的組合物。

種子處理包括本領域中已知的所有適合的種子處理技術，例如拌種、種子包衣、種子撒粉、浸種以及種子造粒。可以藉由任何已知的方法實現具有式 I 之化合物的種子處理施用，如，在該等種子播種之前或播種/種植過程中噴霧或藉由撒粉。

適宜的目標植物特別是穀物，如小麥、大麥、黑麥、燕麥、水稻、玉米或高粱；甜菜，如糖或飼料甜菜；果實，例如仁果，核果或無核水果，如蘋果、梨、李子、桃、扁桃、櫻桃或漿果，例如草莓、樹莓或黑莓；豆科植物，如豆類、扁豆、豌豆或大豆；油料植物，如油菜、芥菜、嬰栗、橄欖、向日葵、椰子、蓖麻、可可或落花生；瓜類作物，如南瓜、黃瓜或甜瓜；纖維植物，如棉花、亞麻、大麻或黃麻；柑橘屬果實，如柳橙、檸檬、葡萄柚或橘子；蔬菜，如菠菜、萵苣、蘆筍、捲心菜、胡蘿蔔、洋蔥、番茄、馬鈴薯或甜椒；樟科植物，如鱷梨、樟（Cinnamomum）或樟腦；並

且還有煙草、堅果、咖啡、茄子、甘蔗、茶、胡椒、葡萄藤、啤酒花、車前草科、乳膠植物以及觀賞植物（例如花以及草坪植物或草皮）。

在實施方式中，該植物選自穀物、玉米、大豆、稻、甘蔗、蔬菜以及油料植物。

術語“植物”應理解為還包括藉由使用重組 DNA 技術轉形的植物，該等植物能夠合成一種或多種選擇性作用毒素，例如已知，來自產毒素的細菌，尤其是芽孢桿菌屬的那些。

可藉由此類轉基因植物表現的毒素包括，例如來自於枯草芽孢桿菌或日本甲蟲芽孢桿菌的殺蟲蛋白質；或來自於蘇雲金芽孢桿菌的殺蟲蛋白質，如 δ -內毒素，例如 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1 或 Cry9C，或植物性殺蟲蛋白（Vip），例如 Vip1、Vip2、Vip3 或 Vip3A；或線蟲寄生細菌的殺蟲蛋白質，例如光桿狀菌屬或致病桿菌屬，如發光光桿狀菌、嗜線蟲致病桿菌；由動物產生的毒素，如蠍毒素、蜘蛛毒素、黃蜂毒素和其他昆蟲特異性神經毒素；由真菌產生的毒素，如鏈黴菌毒素；植物凝集素，如豌豆凝集素、大麥凝集素或雪花蓮凝集素；凝集素類；蛋白酶抑制劑，如胰蛋白酶抑制劑、絲胺酸蛋白酶抑制劑、馬鈴薯貯存蛋白（patatin）、半胱胺酸蛋白酶抑制劑、木瓜蛋白酶抑制劑；核糖體失活蛋白（RIP），如蓖麻蛋白、玉米-RIP、相思豆毒蛋白、絲瓜籽毒蛋白、皂草毒素蛋白或異株瀉根毒蛋白；類固醇代謝酶，如 3-羥基類固醇氧化酶、蛻皮類固醇-UDP-糖苷基-轉移酶、膽固醇氧化酶、蛻皮激素抑制劑、HMG-COA-還原酶，離子通道阻斷劑，如鈉通道或鈣通道阻斷劑，保幼激素酯酶，利尿激素受體、芪合成酶、聯苳合成酶、幾丁酶和葡聚糖酶。

在本發明背景下， δ -內毒素例如 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1 或 Cry9C，或植物性殺蟲蛋白（Vip），例如 Vip1、Vip2、Vip3 或 Vip3A 應理解為顯然還包括混合型毒素、截短的毒素和經修

飾的毒素。混合型毒素係藉由那些蛋白的不同區域的新組合重組產生的(參見,例如 WO 02/15701)。截短的毒素例如截短的 Cry1Ab 係已知的。在經修飾的毒素的情況下,天然存在的毒素的一個或多個胺基酸被置換。在這種胺基酸置換中,較佳的是將非天然存在的蛋白酶識別序列插入毒素中,例如在 Cry3A055 的情況下,組織蛋白酶-G-識別序列被插入 Cry3A 毒素(參見 WO 03/018810)。

這樣的毒素或能夠合成這樣的毒素的轉基因植物的實例揭露於例如 EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451 878 以及 WO 03/052073 中。

用於製備這樣的轉基因植物的方法對於熟習該項技術者是大體上已知的並且描述在例如以上提及的公開案中。CryI-型去氧核糖核酸及其製備例如從 WO 95/34656、EP-A-0 367 474、EP-A-0 401 979 以及 WO 90/13651 中已知。

包含在轉基因植物中的毒素使得植物對有害昆蟲有耐受性。該等昆蟲可以存在於任何昆蟲分類群,但尤其是通常在甲蟲(鞘翅目)、雙翅昆蟲(雙翅目)以及蝴蝶(鱗翅目)中發現。

包含一種或多種編碼殺蟲劑抗性並且表現一種或多種毒素的基因的轉基因植物係已知的並且其中一些係可商購的。這樣的植物的實例係: YieldGard® (玉米品種,表現 CryIAb 毒素); YieldGard Rootworm® (玉米品種,表現 Cry3Bb1 毒素); YieldGard Plus® (玉米品種,表現 Cry1AB 以及 Cry3Bb1 毒素); Starlink® (玉米品種,表現 Cry9C 毒素); Herculex I® (玉米品種,表現 Cry1Fa2 毒素以及實現對除草劑草丁膦銨的耐受性的酶膦絲菌素 N-乙醯轉移酶(PAT)); NuCOTN 33B® (棉花品種,表現 Cry1Ac 毒素); Bollgard I® (棉花品種,表現 Cry1Ac 毒素); Bollgard II® (棉花品種,表現 Cry1Ac 和 Cry2Ab 毒素); VipCot® (棉花品種,表現 Vip3A 和 Cry1Ab 毒素);

NewLeaf® (馬鈴薯品種，表現 Cry3A 毒素)；NatureGard®，Agrisure® GT Advantage (GA21 耐草甘膦性狀)，Agrisure® CB Advantage (Bt11 玉米螟 (CB) 性狀) 以及 Protecta®。

這樣的轉基因植物的其他實例係：

1. Bt11 玉米，來自先正達種子公司 (Syngenta Seeds SAS)，Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur，法國，登記號 C/FR/96/05/10。遺傳修飾的玉蜀黍，藉由轉基因表現截短的 Cry1Ab 毒素，使之能抵抗歐洲玉米螟 (玉米螟和粉莖螟) 的侵襲。Bt11 玉米還轉基因地表現 PAT 酶以達到對除草劑草丁膦銨鹽的耐受性。

2. Bt176 玉米，來自先正達種子公司 (Syngenta Seeds SAS)，Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur，法國，登記號 C/FR/96/05/10。遺傳修飾的玉蜀黍，藉由轉基因表現 Cry1Ab 毒素，使之能抵抗歐洲玉米螟 (玉米螟和粉莖螟) 的侵襲。Bt176 玉米還轉基因地表現 PAT 酶以達到對除草劑草丁膦銨鹽的耐受性。

3. MIR604 玉米，來自先正達種子公司 (Syngenta Seeds SAS)，Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur，法國，登記號 C/FR/96/05/10。藉由轉基因表現經修飾的 Cry3A 毒素使之具有昆蟲抗性的玉米。此毒素係藉由插入組織蛋白酶-G-蛋白酶識別序列而經修飾的 Cry3A055。這樣的轉基因玉米植物的製備描述於 WO 03/018810 中。

4. MON 863 玉米，來自孟山都公司 (Monsanto Europe S.A.)，270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 布魯塞爾，比利時，登記號 C/DE/02/9。MON 863 表現 Cry3Bb1 毒素，並且對某些鞘翅目昆蟲有抗性。

5. IPC 531 棉花，來自孟山都公司 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 布魯塞爾，比利時，登記號 C/ES/96/02。

6. 1507 玉米，來自先鋒環球公司 (Pioneer Overseas Corporation) (比利

時，布魯塞爾，Avenue Tedesco, 7B-1160），登記號 C/NL/00/10。遺傳修飾的玉米，表現蛋白質 Cry1F 以實現對某些鱗翅目昆蟲的抗性和表現 PAT 蛋白質以實現對除草劑草丁膦銨鹽的耐受性。

7. NK 603 × MON 810 玉米，來自孟山都公司（Monsanto Europe S.A.），270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 布魯塞爾，比利時，登記號 C/GB/02/M3/03。藉由將遺傳修飾的品種 NK 603 和 MON 810 雜交，由常規育種的雜交玉米品種構成。NK 603 × MON 810 玉米轉基因表現由土壤桿菌屬菌株 CP4 獲得的 CP4 EPSPS 蛋白質，使之耐除草劑 Roundup®（含有草甘膦），以及由蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克亞種獲得的 Cry1Ab 毒素，使之耐某些鱗翅目昆蟲，包括歐洲玉米螟。

通常，以包含載體的組合物（例如，配製物）的形式使用本發明的化合物。本發明的化合物及其組合物能以不同的形式使用，例如，氣溶膠噴霧器、膠囊懸浮液、冷霧化濃縮物、可粉塵化粉劑、可乳化的濃縮物、水包油乳液、油包水乳液、膠囊化顆粒、細顆粒（fine granule）、用於種子處理的可流動的濃縮物、氣體（壓力下）、產氣產品、顆粒、熱霧化濃縮物、大粒劑、微顆粒（microgranule）、油可分散的粉劑、油可混的可流動的濃縮物、油可混的液體、糊劑、植物棒劑、用於乾種子處理的粉劑、包衣有殺有害生物劑的種子、可溶的濃縮物、可溶的粉劑、用於種子處理的溶液、懸浮液濃縮物（可流動的濃縮物）、超低容量（ulv）液劑、超低容量（ulv）、懸浮液水可分散顆粒或片劑、用於漿料處理的水可分散粉劑、水溶性顆粒或片劑、用於種子處理的水溶性粉劑以及可濕性粉劑。

配製物典型地包括液體或固體載體以及任選地一種或多種常用的、可以是固體或液體助劑的配製助劑，例如，非環氧化的或環氧化的植物油（例如，環氧化的椰子油、菜籽油或豆油），消泡劑，例如矽油，防腐劑，黏土，無機化合物，黏度調節劑，表面活性劑，黏合劑和/或增黏劑。該組合物還

可以進一步包括肥料、微量營養素供體或其他影響植物生長的製品，以及包括組合，該組合包含本發明的化合物以及一種或多種其他生物活性劑，如殺細菌劑、殺真菌劑、殺線蟲劑、植物活化劑、殺蟎劑以及殺昆蟲劑。

因此，本發明還使得組合物可得，該組合物包含本發明的化合物以及農業經濟上的載體以及任選地一種或多種常用的配製助劑。

該等組合物以本身已知的方法來製備，在沒有助劑的存在下例如藉由研磨、篩分和/或壓擠本發明的固體的化合物以及在至少一種助劑的存在下例如藉由將該本發明的化合物與一種或多種助劑一起緊密混合和/或研磨。在本發明的固體化合物的情況下，該等化合物的研磨/磨碎係為了確保特定的顆粒大小。用於製備該等組合物的該等方法以及用於製備該等組合物的本發明的該等化合物的用途也是本發明的主題。

在農業中使用的組合物的實例係可乳化的濃縮物、懸浮液濃縮物、微乳液、油可分散劑、直接可噴霧或可稀釋的溶液、可塗覆的糊劑，稀釋的乳液，可溶性粉劑，可分散的粉劑，可濕性粉劑，塵劑，顆粒或在聚合物質中的膠囊，該等組合物包括至少一種根據本發明的化合物並且組合物的類型被選擇以適合於預期目的和當時環境。

適合的液體載體的實例係：未氫化的或部分氫化的芳族烴，較佳的是 C_8 至 C_{12} 的烷基苯部分，如二甲苯混合物、烷基化的萘或四氫化萘、脂肪族的或脂環族的烴，如石蠟或環己烷，醇類如乙醇、丙醇或丁醇、乙二醇及它們的醚類和酯類如丙二醇、二丙二醇醚、乙二醇或乙二醇單甲醚或己二醇單乙醚，酮類，如環己酮、異佛爾酮或雙丙酮醇，強極性溶劑，如 N-甲基吡咯啉-2-酮、二甲亞砜或 N,N-二甲基甲醯胺、水，未環氧化的或環氧化的植物油，如未環氧化的或環氧化的菜籽油、蓖麻油、椰子油或大豆油和矽油。

用於例如塵劑和可分散粉劑的固體載體的實例通常是磨碎的天然礦物

如方解石、滑石、高嶺土、蒙脫石或凹凸棒石。爲了改進物理特性，添加高度分散的二氧化矽或高度分散的吸收性聚合物也是可能的。用於顆粒的適合的顆粒吸附性載體係多孔型的，如浮石、磚礫、海泡石或膨潤土，並且適合的非吸附性載體材料係方解石或沙。此外，大量無機或有機天然性質的粒化材料可以使用，特別是白雲石或粉碎的植物殘餘料。

取決於待配製的活性成分的類型，合適的表面活性化合物係非離子型，陽離子型和/或陰離子型表面活性劑或表面活性劑混合物，它們具有良好的乳化、分散和潤濕特性。以下提及的表面活性劑僅視爲實例；在配製物領域中常規使用的且根據本發明適宜的大量其他表面活性劑描述於相關文獻中。

適宜的非離子型表面活性劑係，特別是，脂肪族或脂環族醇的聚乙二醇醚衍生物、飽和的或不飽和脂肪酸的聚乙二醇醚衍生物或烷基苯酚的聚乙二醇醚衍生物，該等聚乙二醇醚衍生物在(環)脂肪族的烴基團中可以包含約 3 至約 30 個乙二醇醚基團和約 8 至約 20 個碳原子或者在烷基苯酚的烷基部分中包含約 6 至約 18 個碳原子。還適宜的是與聚丙二醇、乙烯二胺基聚丙二醇或烷基聚丙二醇（在烷基鏈中具有 1 至約 10 個碳原子，以及具有約 20 至約 250 個乙二醇醚基團與約 10 至約 100 個丙二醇醚基團）的水溶性聚環氧乙烷加合物。通常，上述化合物每個丙二醇單位包含 1 至約 5 個乙二醇單位。可以提及的實例係壬苯醇醚、蓖麻油聚乙二醇醚、聚丙二醇/聚環氧乙烷加合物、三丁基苯氧基聚乙氧基乙醇、聚乙二醇或辛基苯氧基聚乙氧基乙醇。還適宜的是聚氧基乙烯脫水山梨醇的脂肪酸酯，如聚氧基乙烯脫水山梨醇三油酸酯。

該等陽離子型表面活性劑特別是通常具有至少一個烷基殘基（約 8 至約 22 個 C 原子）作爲取代基以及低級烷基或烴基烷基或苄基殘基作爲其他取代基（未鹵化或鹵化的）的季銨鹽。該等鹽較佳的是以鹵化物、甲基硫

酸鹽或乙基硫酸鹽的形式。實例係硬脂基三甲基氯化銨和苄基雙(2-氯乙基)乙基溴化銨。

適宜的陰離子型表面活性劑的實例係水溶性皂類或水溶性的合成的表面活性化合物。適宜的皂類的實例係具有約 10 至約 22 個 C 原子的脂肪酸的鹼金屬鹽、鹼土金屬鹽或（未被取代的或被取代的）銨鹽，如油酸或硬脂酸或天然脂肪酸混合物（可得自例如椰子油或妥爾油）的鈉鹽或鉀鹽；還必須提及的是脂肪酸甲基牛磺酸鹽。然而，更常用的是合成的表面活性劑，特別是脂肪磺酸鹽、脂肪硫酸鹽、磺化的苯并咪唑衍生物或烷基芳基磺酸鹽。通常，該等脂肪磺酸鹽和脂肪硫酸鹽表現為鹼金屬鹽、鹼土金屬鹽或（經取代的或未經取代的）銨鹽並且它們通常具有約 8 至約 22 個 C 原子的烷基殘基，烷基還理解為包括醯基殘基的烷基部分；可以提及的實例係木質素磺酸的鈉或鈣鹽，十二烷基硫酸酯的鈉或鈣鹽或由天然脂肪酸製備的脂肪醇硫酸酯混合物的鈉或鈣鹽。該組還包括脂肪醇/環氧乙烷加合物的硫酸鹽和磺酸鹽。該等磺化的苯并咪唑衍生物較佳的是包含 2 個磺醯基基團和約 8 至約 22 個 C 原子的脂肪酸殘基。烷基芳基磺酸鹽的實例係癸基苯磺酸、二丁基萘磺酸或萘磺酸/甲醛縮合物的鈉、鈣或三乙醇銨鹽。此外，還可能的是適宜的磷酸鹽，如對-壬基苯酚/(4-14)環氧乙烷加合物的磷酸酯鹽，或磷脂。

通常情況下，該等組合物包含 0.1%至 99%（特別是 0.1%至 95%）的根據本發明的化合物以及 1%至 99.9%（特別是 5%至 99.9%）的至少一種固體或液體載體，原則上可能的是該組合物的 0%至 25%（特別是 0.1%至 20%）為表面活性劑（在每種情況下%表示重量百分比）。然而對於商品而言，濃縮的組合物通常是較佳的，終端使用者原則上使用具有顯著更低濃度的活性成分的稀釋組合物。較佳的組合物特別是組成如下（% = 重量百分比）：

可乳化的濃縮物：

活性成分： 1%至 95%，較佳的是 5%至 20%

表面活性劑： 1%至 30%，較佳的是 10%至 20%

溶劑： 5%至 98%，較佳的是 70%至 85%

塵劑：

活性成分： 0.1%至 10%，較佳的是 0.1%至 1%

固體載體： 99.9%至 90%，較佳的是 99.9%至 99%

懸浮液濃縮物以及可流動的濃縮物：

活性成分： 5%至 75%，較佳的是 10%至 50%

水： 94%至 24%，較佳的是 88%至 30%

表面活性劑： 1%至 40%，較佳的是 2%至 30%

可濕性粉劑：

活性成分： 0.5%至 90%，較佳的是 1%至 80%

表面活性劑： 0.5%至 20%，較佳的是 1%至 15%

固體載體： 5%至 99%，較佳的是 15%至 98%

顆粒：

活性成分： 0.5%至 30%，較佳的是 3%至 15%

固體載體： 99.5%至 70%，較佳的是 97%至 85%

配製物實例（% = 重量百分比）

實例 F1：乳液濃縮物	a)	b)	c)
活性成分	25%	40%	50%
十二烷基苯磺酸鈣	5%	8%	6%
蓖麻油聚乙烯			
乙二醇醚（36 mol 的 EO）	5%	-	-
三丁基苯氧基聚乙二醇醚（30 mol 的 EO）	-	12%	4%
環己酮	-	15%	20%



二甲苯混合物 65% 25% 20%

任何所希望的濃度的乳液可以從該等濃縮物藉由用水稀釋來製備。

實例 F2：溶液	a)	b)	c)	d)
活性成分	80%	10%	5%	95%
乙二醇單甲醚	20%	-	-	-
聚乙二醇 (MW 400)	-	70%	-	-
N-甲基吡咯啉-2-酮	-	20%	-	-
環氧化的椰子油	-	-	1%	5%
石油醚 (沸程：160°-190°)	-	-	94%	-

該等溶液適合以微滴的形式使用。

實例 F3：顆粒	a)	b)	c)	d)
活性成分	5%	10%	8%	21%
高嶺土	94%	-	79%	54%
高度分散的二氧化矽	1%	-	13%	7%
凹凸棒石	-	90%	-	18%

將該活性成分溶解於二氯甲烷中，將該溶液噴霧在該載體或該等載體上並且隨後將溶劑在真空下進行蒸發。

實例 F4：塵劑	a)	b)
活性成分	2%	5%
高度分散的二氧化矽	1%	5%
滑石	97%	-
高嶺土	-	90%

藉由將載體與活性成分密切混合獲得即用型塵劑。

實例 F5：可濕性粉劑	a)	b)	c)
活性成分	25%	50%	75%

木質素磺酸鈉	5%	5%	-
月桂基硫酸鈉	3%	-	5%
二異丁基萘磺酸鈉	-	6%	10%
辛基苯氧基聚乙二醇醚（7-8 mol EO）	-	2%	-
高度分散的二氧化矽	5%	10%	10%
高嶺土	62%	27%	-

將該活性成分與該等添加劑混合並且在適合的研磨機中將該混合物進行充分研磨。這給出了可濕性粉劑，該等可濕性粉劑可以用水進行稀釋以給出任意的所希望的濃度的懸浮液。

實例 F6：擠出機顆粒

活性成分	10%
木質素磺酸鈉	2%
羧甲基纖維素	1%
高嶺土	87%

將該活性成分與該等添加劑進行混合並且將該混合物進行研磨，用水濕潤，擠出，粒化，並且在空氣流中進行乾燥。

實例 F7：包衣顆粒

活性成分	3%
聚乙二醇（MW 200）	3%
高嶺土	94%

在混合器中，將這種精細研磨的活性成分均勻地施用至已經用聚乙二醇濕潤的高嶺土上。這給出了無塵的包衣顆粒。

實例 F8：懸浮液濃縮物

活性成分	40%
乙二醇	10%



壬基苯氧基聚乙二醇醚（15 mol 的 EO）	6%
木質素磺酸鈉	10%
羧甲基纖維素	1%
37 % 甲醛水溶液	0.2%
矽油（75 % 水性乳液）	0.8%
水	32%

將這種精細研磨的活性成分與添加劑進行緊密地混合。任何所希望的濃度的懸浮液可以從由此所得的懸浮液濃縮物藉由用水稀釋來製備。

實例 F9：用於乾種子處理的粉劑	a)	b)	c)
活性成分	25%	50%	75%
輕質礦物油	5%	5%	5%
高度分散的矽酸	5%	5%	-
高嶺土	65%	40%	-
滑石	-	-	20%

將該組合與該等佐劑充分混合並且將混合物在適當的研磨機中充分研磨，從而獲得了可以直接用於種子處理的粉末。

實例 F10：可乳化的濃縮物	
活性成分	10%
辛酚聚乙二醇醚	3%
（4-5 mol 環氧乙烷）	
十二烷基苯磺酸鈣	3%
蓖麻油聚乙二醇醚（35 mol 氧化乙烯）	4%
環己酮	30%
二甲苯混合物	50%

在植物保護中可以使用的具有任何所要求的稀釋的乳液可以藉由用水稀釋從這種濃縮物中獲得。



實例 F11：用於種子處理的可流動濃縮物

活性成分	40%
丙二醇	5%
共聚物丁醇 PO/EO	2%
三苯乙烯酚，具有 10-20 莫耳 EO	2%
1,2-苯并異噻唑啉-3-酮（處於在水中 20%的溶液的形式）	0.5%
單偶氮-顏料鈣鹽	5%
矽油（處於在水中 75%的乳液的形式）	0.2%
水	45.3%

將這種精細分散的組合與該等佐劑緊密地混合，從而給出了懸浮液濃縮物，可以使用水稀釋從該懸浮液獲得任何所希望的稀釋物。使用這樣的稀釋物，可以藉由噴霧、傾倒或浸漬對活的植物以及植物繁殖材料進行處理並且保護它們免受微生物侵染。

用於預混組合物的葉配製物類型的實例係：

GR：顆粒

WP：可濕性粉劑

WG：水可分散顆粒（粉末）

SG：水溶性的顆粒

SL：可溶的濃縮物

EC：可乳化的濃縮物

EW：乳液，水包油

ME：微乳液

SC：水性懸浮液濃縮物

CS：水性膠囊懸浮液

OD：基於油的濃縮物，以及

SE：水性懸乳液。

而預混組合物的種子處理配製物類型的實例係：

WS：用於種子處理漿料的可濕性粉劑

LS：用於種子處理的溶液

ES：用於種子處理的乳液

FS：用於種子處理的懸浮液濃縮物

WG：水可分散顆粒，以及

CS：水性膠囊懸浮液。

適合於桶混組合物的配製物類型的實例係溶液、稀釋乳液、懸浮液或其混合物、以及塵劑。

對於該等配製物的性質，本發明的方法，例如葉、濕透、噴霧、霧化、粉塵化、撒播、包衣或傾倒可以根據所打算的目的以及占主導的環境進行選擇。

該等桶混組合物總體上藉由用溶劑（例如，水）來稀釋一種或多種含不同殺有害生物劑以及任選地另外的輔助劑的預混組合物而製備。

適當的載體以及佐劑可以是固體或液體的並且是在配製物技術中常用的物質，例如天然或再生的礦物物質，溶劑、分散體、濕潤劑、增黏劑、增稠劑、黏合劑或肥料類。

總體上，用於葉或土壤施用的桶混配製物包括 0.1% 至 20%，尤其是 0.1% 至 15% 的所希望的成分，以及 99.9% 至 80%，尤其是 99.9% 至 85% 的固體或液體助劑（包括例如溶劑，如水），而該等助劑可以是表面活性劑，其量基於該桶混配製物係 0 至 20%，尤其是 0.1% 至 15%。

典型地，用於葉施用的預混配製物包括 0.1% 至 99.9%，尤其是 1% 至 95% 的所希望的成分，以及 99.9% 至 0.1%，尤其是 99% 至 5% 的固體或液體佐劑（包括例如溶劑，如水），其中該等助劑可以是表面活性劑，其量基於該預混配製物係 0 至 50%，尤其是 0.5% 至 40%。

通常，用於種子處理施用的桶混配製物包括 0.25%至 80%，尤其是 1%至 75%的所希望的成分，以及 99.75%至 20%，尤其是 99%至 25%的固體或液體助劑（包括例如溶劑，如水），其中該等助劑可以是表面活性劑，其量基於該桶混配製物係 0 至 40%，尤其是 0.5%至 30%。

典型地，用於種子處理施用的預混配製物包括 0.5%至 99.9%，尤其是 1%至 95%的所希望的成分，以及 99.5%至 0.1%，尤其是 99%至 5%的固體或液體佐劑（包括例如溶劑，如水），其中該等助劑可以是表面活性劑，其量基於該預混配製物係 0 至 50%，尤其是 0.5%至 40%。

而商用的產品較佳的是被配製為濃縮物（例如，預混組合物（配製物）），最終使用者通常使用稀釋的配製物（例如，桶混組合物）。

較佳的種子處理預混配製物係水性懸浮濃縮物。該配製物可以使用常規的處理技術以及機器，例如流化床技術、滾筒研磨方法、靜態轉動（rotostatic）種子處理器以及轉鼓包衣器施用到種子上。其他方法，例如噴出床也可以是有用的。該等種子可以在包衣之前進行預分級。包衣之後，將該等種子典型地進行乾燥並且然後轉移到分級機器（sizing machine）中用於分級。這樣的方法在本領域中是熟知的。

總體上，本發明的預混組合物包括按質量計 0.5%至 99.9%，尤其是 1%至 95%，有利地 1%至 50%的所希望的成分，以及按質量計 99.5%至 0.1%，尤其是 99%至 5%的固體或液體佐劑（包括例如溶劑，如水），其中該等助劑（或佐劑）可以是表面活性劑，其量基於該預混配製物係按質量計 0 至 50%，尤其是 0.5%至 40%。

在較佳實施方式中，獨立於任何其他實施方式，具有式 (I) 之化合物處於處理（或保護）植物繁殖材料的組合物的形式，其中所述保護植物繁殖材料的組合物此外包括著色劑。這種保護植物繁殖材料的組合物或混合

物還可以包括至少一種來自水溶的以及水可分散的成膜聚合物的聚聚物，該等成膜聚合物提高了活性成分到經處理植物繁殖材料上的附著，該聚合物總體上具有至少 10,000 至約 100,000 的平均分子量。

本發明的該等組合（即，包括本發明的化合物以及一種或多種其他的生物活性劑的那些）可同時地或順序地施用。

在這種情況下，順序地施用組合的成分（即，逐一地），在相互合理的週期之內順序地施用該等成分，以達到生物性能，如在幾小時或幾天之內。該組合中的該等成分的施用順序，即具有式 (I) 之化合物是否應該被首先施用，對於實施本發明並不是關鍵的。

在這種情況下，在本發明中將該等組合的成分同時施用，它們可以作為含該組合的組合物施用，在這種情況下，(A) 該等組合中的具有式 (I) 之化合物以及該一種或多種其他成分可以從分開的配製物來源獲得並且一起進行混合（稱為桶混、即用型、噴霧液（spray broth）或漿料），或者 (B) 具有式 (I) 之化合物以及該一種或多種其他成分可以作為單一的配製物混合物來源獲得（稱為預混、即混、濃縮物或配製的產品）。

在實施方式中，獨立於其他實施方式，將根據本發明的化合物作為組合施用。因此，本發明還提供一種組合物，該組合物包括如在此所述的、根據本發明的化合物以及一種或多種其他生物活性劑以及任選地一種或多種常規的配製物助劑；該組合物可以處於桶混或預混組合物的形式。

作為關於生物活性的實際協同作用的替代方案，根據本發明的該等組合還可以具有出人意料的有利的特性，該等特性在更廣義上可以是作為協同活性所希望的。可以提及的此類有利的特性的實例係：在配製和/或施用（例如當研磨、篩選、乳化、溶解或分散時）過程中有利的行為；增加的

存儲穩定性、改進的光穩定性；更有利的可降解性；改進的毒理學和/或生態毒理學的行爲；或熟習該項技術者熟悉的其他優點。

本發明的該等化合物在農業中較佳的是用作殺線蟲劑。

本發明的該等化合物還可以在其他領域中找到應用，如以下一項或多項：儲藏貨物和儲藏室的保護，原材料（如木板和紡織品）的保護，地板覆蓋物及建築物的保護，以及在衛生管理中-尤其是保護人、家畜以及生產性家畜對抗有害生物。因此本發明還使得用於此類用途的殺有害生物組合物及用於它的方法可得。用於在具體用途中使用的該組合物將需要被修飾，並且普通技術人員將能夠使得用於任何具體用途的此類組合物可得。

在衛生領域中，根據本發明的該等組合物係有效地對抗外寄生蟲如硬蜱、軟蜱、疥蟎、秋蟎、蠅（叮咬和舔舐）、寄生性蠅幼蟲，虱、發虱、鳥虱和蚤。

此類寄生蟲的實例係：

-虱目：血虱屬、長顎虱屬、人虱屬和陰虱屬、盲虱屬。

-食毛目：毛羽虱屬、禽虱屬、巨羽虱屬、牛羽虱屬、*Werneckiella* spp.、*Lepikentron* spp.、畜虱屬、齧毛虱屬和貓羽虱屬。

-雙翅目及長角亞目和短角亞目，例如伊蚊屬、按蚊屬、庫蚊屬、蚋屬、真蚋屬、白蛉屬、羅蛉屬、庫蠓屬、斑虻屬、駝背虻屬、黃虻屬、虻屬、麻虻屬、*Philipomyia* spp.、蜂虱蠅屬、家蠅屬、齒股蠅屬、螫蠅屬、黑角蠅屬、莫蠅屬、廁蠅屬、舌蠅屬、麗蠅屬、綠蠅屬、金蠅屬、汙蠅屬、麻蠅屬、狂蠅屬、皮蠅屬、胃蠅屬、虱蠅屬、羊虱蠅屬和蜉蠅屬。

-蚤目，例如蚤屬、櫛頭蚤屬、客蚤屬、角葉蚤屬。

-異翅目，例如臭蟲屬、錐蝽屬、紅獵蝽屬、錐蝽屬。

-蜚蠊目，例如東方蠊、美洲大蠊、德國小蠊和夏柏拉蟑螂屬。

-蜱蟎亞綱（蟎科）和後氣門目和中氣門目，例如銳緣蜱屬、鈍緣蜱屬、耳蜱屬、硬蜱屬、鈍眼蜱屬、牛蜱屬、革蜱屬、血蜱屬、璃眼蜱屬、扇頭蜱屬、皮刺蟎屬、刺利蟎屬、肺刺蟎屬、胸刺蟎屬和瓦蟎屬。

-軸蟎目（前氣門亞目）和粉蟎目（無氣門亞目），例如蜂盾蟎屬、姬螯屬、禽螯蟎屬、肉蟎屬、瘡蟎屬、蠕形蟎屬、恙蟎屬、聲蟎屬、粉蟎屬、食酪蟎屬、嗜木蟎屬、頸下蟎屬、翅蟎屬、癢蟎屬、皮蟎屬、耳疥蟎屬、疥蟎屬、耳蟎屬、鳥疥蟎屬、胞蟎屬和雞雛蟎屬。

根據本發明的該等組合物還適用於保護材料如木材、紡織品、塑膠、黏合劑、膠、漆料、紙張和卡片、皮革、地板和建築等免受昆蟲侵染。根據本發明的該等組合物可用於，例如，對抗下列有害生物：甲蟲，如北美家天牛、多毛綠虎天牛、傢俱竊蠹、報死竊蠹、*Ptilinuspecticornis*、*Dendrobium pertinex*、細齒叉尾長蠹、*Priobium carpini*、褐粉蠹、非洲粉蠹、南方粉蠹、抱扁蠹、軟毛粉蠹、扁腿粉蠹、鱗毛粉蠹、材小蠹屬、木小蠹屬、黑長蠹、紅腹榲長蠹、棕異翅長蠹、雙棘長蠹屬以及竹蠹，並且還有膜翅目，如藍黑樹蜂、大樹蜂、泰加大樹蜂和 *Urocetus augu*，以及白蟻類，如黃頸木白蟻、麻頭堆砂白蟻、印巴結構木異白蟻、黃肢散白蟻、桑特散白蟻、歐洲散白蟻、達氏澳白蟻、內華達動白蟻和臺灣家白蟻，以及無翼昆蟲類，如衣魚。

對儲藏貨物、儲藏室、原材料（如木板及紡織品）、地板覆蓋物及建築物，以及在衛生管理中施用化合物或其組合物的施用方法在本領域中是已知的。

本發明還提供了一種用於處理、治療、控制、防止並保護溫血動物（包括人和魚）對抗由蠕蟲、蛛形綱以及節肢動物體內-和體外寄生蟲引起的侵染及感染的方法，該方法包括經口地、局部地或腸胃外向所述動物給予或施用驅蠕蟲、殺蟎或殺體內-或體外寄生蟲有效量的具有式 (I) 之化合物。

上述方法對控制和防止溫血動物中的蠕蟲、線蟲、蟎以及節肢動物體

內-和體外寄生蟲的侵染及感染特別有用，該等溫血動物如牛、綿羊、豬、駱駝、鹿、馬、家禽、魚、兔、山羊、水貂、狐狸、灰鼠、狗和貓以及人。

在控制和防止溫血動物中的侵染及感染的上下文背景中，本發明的化合物對蠕蟲以及線蟲的控制尤其有用。蠕蟲的實例係吸蟲綱的成員，通常被稱為吸蟲或扁形動物，尤其是片吸蟲屬、擬片吸蟲屬、同盤吸蟲屬、雙腔吸蟲屬、闊盤吸蟲屬、*Ophisthorchis*、薑片蟲屬、棘口吸蟲屬以及並殖吸蟲屬的成員。可以由具有式 (I) 之化合物控制的線蟲包括血矛線蟲屬、胃線蟲屬、古柏線蟲屬、*Oesphagastomu*、細頸線蟲屬、網尾線蟲屬、鞭蟲屬、惡絲蟲屬、鉤蟲屬 (*Ancylostoma*)、蛔蟲屬以及類似屬。

本發明的化合物還可以控制體內寄生的節肢動物的侵染，如紋皮蠅以及胃膚蠅幼蟲。此外，在溫血動物以及魚類中的蟎和節肢動物體外寄生侵染包括咬虱、吸吮虱、膚蠅、咬蠅、麝香蠅 (*muscoid flies*)、蒼蠅 (*flies*)、*myiasitic fly* 幼蟲、蠓蟲 (*gnats*)、蚊子 (*mosquitoes*)、蚤 (*fleas*)、蟎類 (*mites*)、蜱 (*ticks*)、鼻膚蠅 (*nasal bots*)、羊蜱蠅以及恙蟎可以被本發明的該等化合物控制、防止或消除。咬虱包括食毛目的成員如牛毛虱、犬齧毛虱以及綿羊毛虱 (*Damalina ovis*)。吸吮虱包括虱目的成員如牛血虱、豬血虱、牛顎虱以及水牛盲虱。咬蠅包括黑角蠅屬的成員。蜱包括牛蜱屬、扇頭蜱屬、硬蜱屬、璃眼蜱屬、鈍眼蜱屬以及矩頭蟬屬。本發明的該等化合物還可以用於控制寄生在溫血哺乳動物以及家禽上的蟎類，包括真蟎目以及寄蟎目的蟎類。

對於經口向溫血動物給予，可以將本發明的該等化合物配製成動物飼料、動物飼料預混物、動物飼料濃縮物、丸劑、溶液、糊劑、懸浮液、獸用灌藥、凝膠劑、片劑、大丸劑以及膠囊。此外，還可以將本發明的該等化合物在它們的飲用水中向動物給予。對於經口給予，所選的劑型每天應當對該等動物提供有大約 0.01 mg/kg 至 100 g/kg 動物體重的本發明的化合

物。

可替代地，本發明的該等化合物可以非經腸地，例如，藉由瘤胃內的（intraruminal）、肌內的、靜脈內的或皮下注射向動物給予。可以將本發明的該等化合物分散或溶解於生理學上可接受的載體中，用於皮下注射。可替代地，本發明的該等化合物可以被配製為用於皮下給藥的植入物。此外，本發明的該等化合物可以向動物經皮給予。對於非經腸給予，所選的劑型每天應當對該等動物提供大約 0.01 mg/kg 至 100 mg/kg 動物體重的本發明的化合物。

本發明的該等化合物還能以蘸劑（dips）、塵劑、粉劑、頸圈（collars）、章牌（medallions）、噴霧劑以及傾倒配製物（pour-on formulations）的形式向該等動物局部地施用。對於局部施用，蘸劑以及噴霧劑通常包含大約 0.5 ppm 至 5,000 ppm 並且較佳的是大約 1 ppm 至 3,000 ppm 的本發明的化合物。此外，本發明的該等化合物可以被配製為用於動物，特別是四足動物如牛與綿羊的耳標。

本發明的該等化合物還可以與一種或多種其他殺寄生蟲的化合物組合或結合使用（從而加寬活性範圍），包括但不限於，驅蠕蟲劑如苯并咪唑、吡啶、左旋咪唑、噻吩嘧啶、吡嗪酮以及類似物；內外殺蟲劑（endectocides）如阿巴汀、米爾倍黴素以及類似物；殺體外寄生蟲藥如芳基吡咯、有機磷酸酯、胺基甲酸酯、 γ 丁酸抑制劑（包括氟蟲脞）、擬除蟲菊酯、多殺菌素、吡蟲啉以及類似物；昆蟲生長調節劑如吡丙醚、環丙馬秦以及類似物；以及幾丁質合成酶抑制劑如苯甲醯脲，包括氟蟲脲。

本發明的該等殺寄生蟲組合物包括殺寄生蟲有效量的本發明的化合物或其與一種或多種生理學上可容許的惰性固體或液體載體混合的組合，該等載體已知於用於經口、經皮以及局部給予的獸用藥慣例。此類組合物可以進一步包括多種添加劑，如穩定劑、消泡劑、黏度調節劑、黏合劑以及

增黏劑，而商用的產品將較佳的是被配製為濃縮物，最終使用者將通常使用稀釋的配製物。

根據本發明的該等組合物還可以用於製備有用於治療性或防止性處理人類以及動物真菌疾病的組合物，該等疾病例如像，黴菌病、皮膚病、發癬菌病以及念珠菌病或由麴黴屬例如煙麴黴引起的疾病。

在實施方式中，獨立於任何其他的實施方式，具有式 (I) 之化合物係抗蠕蟲化合物。

在實施方式中，獨立於任何其他的實施方式，具有式 (I) 之化合物係殺有害生物化合物，較佳的是殺線蟲化合物。

在本發明的每個方面以及實施方式中，“主要由……組成的”以及其變化（inflections）係“包括”以及其變化的較佳實施方式，並且“由……組成的”以及其變化係“主要由……組成”以及其變化的較佳實施方式。

本申請的揭露使得在此揭露的實施方式的各自並且每一個組合可得。

以下實例用於說明本發明。它們不限制本發明。溫度以攝氏度的形式給出；溶劑的混合比按體積份數給出。

實施例

製備實施例：

溫度以攝氏度的形式給出；溶劑的混合比按體積計以部分的形式給出。

本部分使用以下縮寫：DMF：二甲基甲醯胺；THF：四氫呋喃；EtOAc：乙酸乙酯；s = 單峰；bs = 寬峰；d = 二重峰；dd = 雙二重峰；dt = 雙三重峰；t = 三重峰；tt = 三三重峰；q = 四重峰；sept = 七重峰；m = 多重峰；Me = 甲基；Et = 乙基；Pr = 丙基；Bu = 丁基；M.p. = 熔點；RT = 滯留時間；[M+H]⁺ = 質子化陽離子的分子量；[M-H]⁻ = 分子陰離子的分子量。

方法 A：

- M 來自沃特斯 (Waters) 的 ZQ 質譜儀 (單四極杆質譜儀)，離子化方法：
- S 電灑，極性：正離子化，毛細管 (kV) 3.00，錐孔 (V) 30.00，提取器：2.00 V，源溫度 (°C) 100，去溶溫度 (°C) 250，錐孔反吹氣流 (L/Hr) 50，去溶氣流 (L/Hr) 400，質量範圍：100 Da 至 900 Da。
- LC 來自安捷倫公司的 1100er Series HPLC：四元泵，加熱的柱室以及二極體陣列檢測器。
- 柱：Phenomenex Gemini C18，3 μ m，30 x 3 mm，溫度：60°C；DAD 波長範圍 (nm)：210 至 500
- 溶劑梯度：
- A = H₂O + 5% MeOH + 0.05% HCOOH
- B = 乙腈 + 0.05% HCOOH

時間 (min)	時間 (min)	時間 (min)	時間 (min)
0.00	0.00	0.00	0.00
2.00	2.00	2.00	2.00
2.80	2.80	2.80	2.80
2.90	2.90	2.90	2.90

方法 B：

- M 來自沃特斯公司 (Waters) 的 ACQUITY SQD 質譜儀 (單四極杆質譜儀)
- S 電離法：電灑
- 極性：正離子類
- 毛細管 (kV) 3.00，錐孔 (V) 20.00，提取器 (V) 3.00，源溫度 (°C) 150，去溶溫度 (°C) 400，錐孔反吹氣流 (L/Hr) 60，去溶氣流 (L/Hr) 700
- 質量範圍：100 Da 至 800 Da
- DAD 波長範圍 (nm)：210 至 400
- LC 使用以下 HPLC 梯度條件的 Method Waters ACQUITY UPLC (溶劑 A：水/甲醇 9：1，0.1%的甲酸和溶劑 B：乙腈，0.1%甲酸)

時間 (min)	A%	B%	流速 (mL/min)
0	100	0	0.75
2.5	0	100	0.75
2.8	0	100	0.75
3.0	100	0	0.75



方法 C：

M 來自沃特斯公司（Waters）的 ZMD 質譜儀（單四極杆質譜儀），離子
S 化方法：電灑，極性：正離子化，毛細管（kV）3.80，錐孔（V）30.00，
提取器：3.00 V，源溫度（℃）150，去溶溫度（℃）350，錐孔反吹氣
流（L/Hr）關，去溶氣流（L/Hr）600，質量範圍：100 Da 至 900 Da。
LC 來自安捷倫公司的 1100er Series HPLC：四元泵，加熱的柱室以及二極
體陣列檢測器。
柱：Phenomenex Gemini C18，3 μm，30 x 3 mm，溫度：60℃；DAD 波
長範圍(nm)：200 至 500
溶劑梯度：
A = H₂O + 5% MeOH + 0.05% HCOOH
B = 乙腈 + 0.05% HCOOH

時間（min）	A%	B%	流速（mL/min）
0.00	100	0.0	1.700
2.00	0	100	1.700
2.80	0	100	1.700
2.90	100	0	1.700
3.00	100	0	1.700

方法D：

來自沃特斯（Waters）的（SDQ 或 ZQ 單四極杆質譜儀）MS 質譜儀，
該質譜儀配備有電灑源（極性：正離子或負離子，毛細管：3.00 kV，錐孔
範圍：30 V-60 V，提取器：2.00 V，源溫度：150℃，去溶溫度：350℃，錐
孔反吹氣流：0 L/Hr，去溶氣流：650 L/Hr；質量範圍：100 Da 至 900 Da）

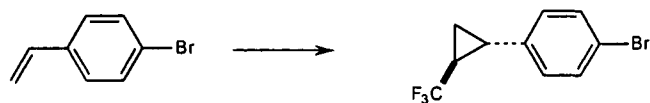
來自沃特斯的LC Acquity UPLC：二元泵，加熱管柱室以及二極體陣列
檢測器。溶劑脫氣裝置，二元泵，加熱管柱室以及二極體陣列檢測器。柱：
Waters UPLC HSS T3，1.8 μm，30 x 2.1 mm，溫度：60℃，DAD波長範圍（nm）：
210至500，溶劑梯度：A = 水 + 5% MeOH + 0.05 % HCOOH，B= 乙腈 + 0.05
% HCOOH：梯度：梯度：0 min 0% B，100%A；1.2-1.5min 100% B；流速(ml/min)
0.85

實施例P1：N-[1,1-二甲基-2-側氧-2-[4-[反式-2-(三氟甲基)-1-環丙基]苯基]



乙基]-2,6-二氟-苯甲醯胺 (19.003) 之製備

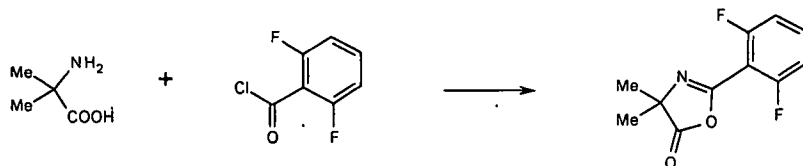
步驟a. 1-溴-4[2-反式-(三氟甲基)-1-環丙基]苯之製備



將 4-溴代苯乙烯 (48 ml, 67.5 g, 369 mmol) 和 Fe(TPP)Cl (7.79 g, 11.1 mmol) 與 600 ml 水中的 2,2,2-三氟乙胺鹽酸鹽 (102 g, 738 mmol) 溶液一起攪拌。將該混合物用機械攪拌器快速攪拌並且使用冰/水浴來冷卻該反應燒瓶。當反應器的溫度降至 15°C 時, 開始添加在 50 ml 的水中的亞硝酸鈉 (61.1 g, 885 mmol) 溶液並且添加一部分。放熱反應以氮的放出起始。溫度升高至 20°C 並且再次下降。以部分地添加亞硝酸鹽溶液, 將溫度保持在 15°C 與 22°C 之間。在完成添加後, 移除冷卻浴並且將該混合物再攪拌 3 小時。樣品的 NMR 顯示完全轉化。將該反應混合物用大約 200 ml 環己烷進行攪拌並且通過矽藻土進行過濾用己烷洗滌。將各層進行分離並且將有機層用 NH₄Cl (5 M, aq) 洗滌並用水洗滌兩次。使有機相通過矽石柱 (高度 15 cm, 直徑 10 cm) 用己烷進一步洗提。蒸發溶劑, 產生 1-溴-4[2-反式-(三氟甲基)-1-環丙基]苯 (70 g)。

¹H-NMR (CDCl₃) 1.13 (1H, m, cPr); 1.38 (1H, m, cPr); 1.77 (1H, m, cPr); 2.32 (1H, m, cPr); 6.99 (2H, Ar); 7.41 (2H, Ar)。

步驟b. 2-(2,6-二氟苯基)-4,4-二甲基-噁唑-5-酮之製備

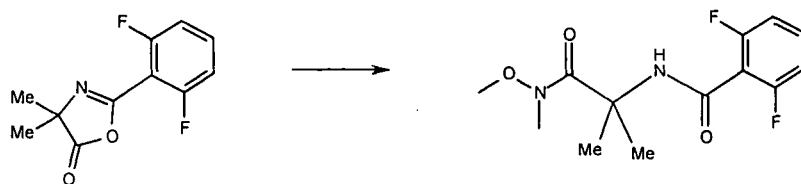


在 0°C 下, 在攪拌下, 向在吡啶 (140 ml) 中的 α-氨基異丁酸 (7.417 g, 71.93 mmol) 的懸浮液中添加 2,6-二氟苯甲醯氯 (20 ml, 159.84 mmol)。允

許將該混合物加溫至室溫並攪拌六天。蒸發溶劑並且將粗產物混合物在醚/己烷 1:4 與水之間搖動。將有機相用 HCl (1 M) 洗滌兩次，用 NaHCO₃ (1 M) 洗滌一次，用 Na₂SO₄ 乾燥，並蒸發，以產生呈淡黃色固體的產物 (14.3 g)。M. p. 36°C-39°C。

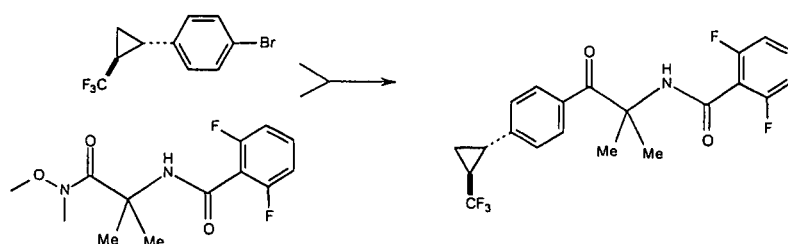
¹H-NMR (CDCl₃, 400MHz) 1.58 (6H, s, 2 x Me); 7.03 (2H, dd, J =9, Ar); 7.50 (1H, m, Ar)。

步驟c. 2,6-二氟-N-[2-[甲氧基(甲基)胺基]-1,1-二甲基-2-側氧-乙基]苯甲醯胺之製備



在室溫下，將 2-(2,6-二氟-苯基)-4,4-二甲基-4H-噁唑-5-酮 (1.90 g, 8.44 mmol)、N,O-二甲基鹽酸脛胺 (1.0 g, 10.1 mmol)、吡啶 (0.80 ml, 10.1 mmol, 1.2 當量)、以及二氯甲烷 (28 ml) 的混合物攪拌 24 小時。藉由在減壓下進行蒸發除去二氯甲烷。將生成的混合物用乙酸乙酯 (150 ml) 進行稀釋，用 5% 的水性 HCl (50 mL) 和飽和水性 NaHCO₃ (50 ml) 洗滌兩次並用 Na₂SO₄ 進行乾燥，除去溶劑，給出呈黃色固體的粗產物 N-[2-(4-環丙基-苯基)-1,1-二甲基-2-側氧-乙基]-2,6-二氟-苯甲醯胺，該物質遞至下一步驟而無需進一步純化。

步驟 d. N-[1,1-二甲基-2-側氧-2-[4-[反式-2-(三氟甲基)-1-環丙基]苯基]乙基]-2,6-二氟-苯甲醯胺 (19.003) 之製備



在-70°C 下，向 2,6-二氟-N-[2-[甲氧基(甲基)胺基]-1,1-二甲基-2-側氧-乙基]苯甲醯胺 (8.64 g, 30.2 mmol, 在 100 ml THF 中) 溶液中緩慢添加在 Bu₂O 中的苯基鋰溶液 (1.8 M, 30.2 mmol, 17 ml)。在-70°C 下，在單獨燒瓶中，向來自步驟 1、在 THF (50 ml) 中的 1-溴-4[2-反式-(三氟甲基)-1-環丙基]苯 (8.00 g, 30.2 mmol) 溶液中緩慢添加在己烷中的 nBuLi (19 ml, 1.6 M, 30.2 mmol)。15 分鐘以後，藉由套管向上述溶液中添加這一新的芳基鋰溶液。在-70°C 下 1 小時之後，添加 NH₄Cl (5 M, 50 ml)，將該混合物加溫至室溫，並且添加 tBuOMe (150 ml) 和水 (100 ml)。將各相進行分離，將有機層用 NaHCO₃ (1 M, 50 ml) 和 NaCl (飽和的, 50 ml) 進行洗滌，用 MgSO₄ 乾燥並蒸發溶劑，以產生呈黃色油狀物、仍包含 Bu₂O 的粗產物 (16.97 g)。

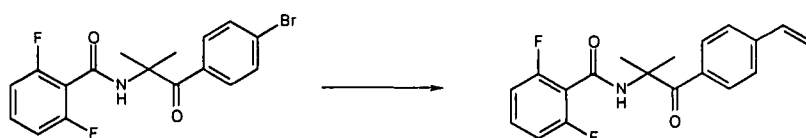
將這一反應效仿以上程序以 240 mmol 規模進行重複，除了用 58 g 的乙酸代替 NH₄Cl (5 M) 淬滅該反應以外。這給出 112 g 的粗品產量、包含 Bu₂O 的粗產物。將這與來自第一反應的 16.95 g 產物一起進行層析分析。用 1.5 kg 的矽土、使用 EtOAc/庚烷梯度進行層析，以產生 67.5 g 的產物，該產物從 Et₂O/己烷結晶化，m.p. 65°C - 80°C。

LCMS (方法 A)。RT 2.11 min [M+H]⁺ 412。

¹H-NMR (CDCl₃, 400 MHz) 1.22 (1H, m, cPr); 1.43 (1H, m, cPr); 1.80 (6H, s, Me₂); 1.84 (1H, m, cPr); 2.48 (1H, m, cPr); 6.89 (2H, t, Ar); 6.92 (1H, br s, NH); 7.16 (2H, d); 7.33 (1H, m, Ar); 7.98 (2H, d, Ar)

實施例 P2：N-[1,1-二甲基-2-側氧-2-[4-[2,2-二氯環丙基]苯基]乙基]-2,6-二氟-苯甲醯胺 (19.002)

步驟 a：N-[1,1-二甲基-2-側氧-2-(4-乙基苯基)]乙基]-2,6-二氟-苯甲醯胺



向在甲苯 (50 ml) 中的 N-[1,1-二甲基-2-側氧-2-(4-溴苯基)乙基]-2,6-二氟-苯甲醯胺 (1 g) 溶液中添加三丁基乙烯基錫 (912 mg)。將溶液脫氣並用氫氣沖洗。添加(四(三苯基磷))鈰 (302 mg) 並且將該溶液在 90°C 下攪拌過夜，然後冷卻至室溫並且藉由添加飽和碳酸鈉水溶液來淬滅並且在室溫下攪拌 4 小時。將該混合物用乙酸乙酯萃取，將有機層用 5% 氨水溶液進行洗滌，用硫酸鈉乾燥並且在減壓下除去溶劑。將粗殘餘物藉由快速層析法 (乙酸乙酯/環己烷) 進行純化，以給出呈深黃色樹膠的標題產物 (1.42 g)。

LCMS (方法 A)。RT 1.74 min $[M+H]^+$ 330。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): 1.82 (s, 6H), 5.38 (d, 1H), 5.85 (d, 1H), 6.21 (dd, 1H), 6.90-7.00 (m, 3H), 7.25 (m, 1H), 7.45 (d, 2H), 8.00 (d, 2H)。

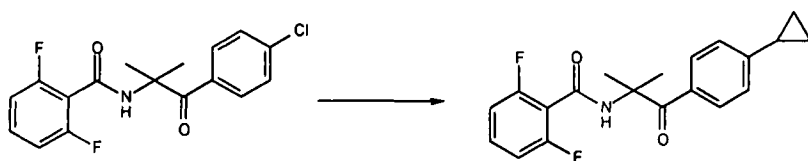
步驟 b: N-[1,1-二甲基-2-側氧-2-[4-[2,2-二氯環丙基]苯基]乙基]-2,6-二氟-苯甲醯胺 (19.002)



在 40°C 下，向在二氯甲烷 (3 ml) 中的 N-[1,1-二甲基-2-側氧-2-(4-乙烯基苯基)乙基]-2,6-二氟-苯甲醯胺 (200 mg)、氫氧化鉀 (170 mg) 和四丁基溴化銨 (39 mg) 的攪拌溶液中滴加氯仿 (362 mg)。重複添加氯仿，直到如藉由 LCMS 分析所評估的，所有的起始材料被消耗。將粗殘餘物藉由快速層析法 (乙酸乙酯/庚烷) 進行純化，以給出呈黃色油狀物的標題產物 (137 mg)。

LCMS (方法 A)。RT 1.87 min $[M+H]^+$ 412/414。

實施例 P3: N-[2-(4-環丙基苯基)-1,1-二甲基-2-側氧-乙基]-2,6-二氟-苯甲醯胺 (19.001) 之製備

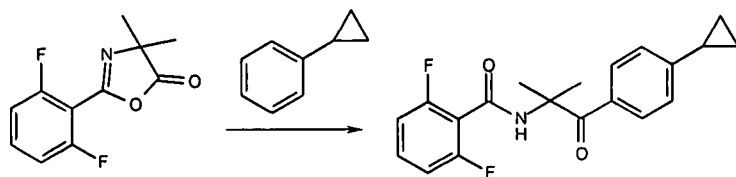


將 N-[1,1-二甲基-2-側氧-2-(4-氯苯基)]乙基]-2,6-二氟-苯甲醯胺 (26 g) 溶解於甲苯 (520 ml) 中。添加環丙基硼酸 (10 g)、三環己基磷 (2.16 g)、磷酸鉀 (57.2 g) 和水 (31 ml)，隨後是乙酸鈣 (0.86 g) 並且將該溶液在 100°C 下攪拌過夜，然後冷卻至室溫並且在水與乙酸乙酯之間進行分配。將該等合併的有機層有用鹽水進行洗滌並且在減壓下除去溶劑。將粗殘餘物藉由快速層析法 (乙酸乙酯/環己烷) 進行純化，以給出呈深黃色膠的標題產物 (48 g)。

LCMS (方法 B)。RT 1.73 min $[M+H]^+$ 344。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): 0.75 (m, 2H), 1.02 (m, 2H), 1.82 (s, 6H), 1.91 (m, 1H), 6.90 (t, 2H), 7.09 (d, 2H), 7.12 (br s, 1H), 7.32 (m, 1H), 7.92 (d, 2H)。

實施例 P4：N-[2-(4-環丙基苯基)-1,1-二甲基-2-側氧-乙基]-2,6-二氟-苯甲醯胺 (19.001) 之替代合成

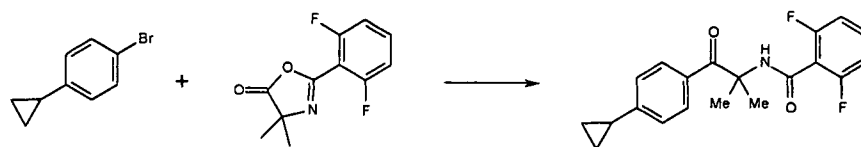


在 0°C 下，向在環丙基苯 (5.47 ml) 中的 2-(2,6-二氟苯基)-4,4-二甲基-噁唑-5-酮 (0.5 g) 溶液中添加三氯化鋁 (0.83 g) 並且將該反應混合物在 0°C 下攪拌 30 min。然後允許將其加溫至室溫並且藉由添加冰和 2 N 鹽酸將該反應混合物分解。將有機層用碳酸氫鈉洗滌，用硫酸鈉乾燥並且將溶劑在真空中進行蒸發。將粗殘餘物藉由快速層析法 (乙酸乙酯/環己烷) 進行純化，以給出呈灰白色膠的標題產物 (0.36 g)。

LCMS (方法 C)。RT 1.77 min $[M+H]^+$ 344。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400 MHz): 0.75 (m, 2H), 1.02 (m, 2H), 1.82 (s, 6H), 1.91 (m, 1H), 6.90 (t, 2H), 7.09 (d, 2H), 7.12 (br s, 1H), 7.32 (m, 1H), 7.92 (d, 2H)。

實施例 P5：N-[2-(4-環丙基苯基)-1,1-二甲基-2-側氧-乙基]-2,6-二氟-苯甲醯胺 (19.001) 之替代合成

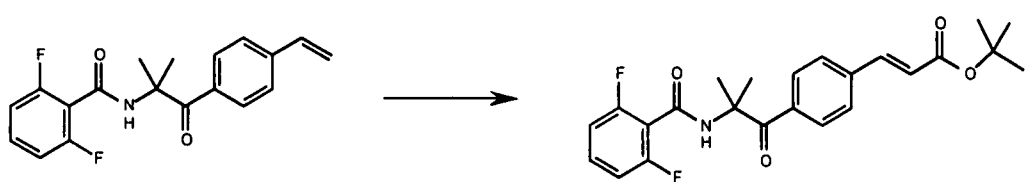


在 -78°C 下，在氬氣下，將在乾 THF (4 ml) 中的 1-溴-4-環丙基-苯 (300 mg, 1.52 mmol) 溶液經 20 分鐘的時間，用 BuLi (在己烷中 1.6N, 1.00 ml, 1.60 mmol) 逐滴地進行處理。在 -78°C 下，向生成的混合物中經 15 分鐘的時間，滴加在乾 THF (1.5 ml) 中的 2-(2,6-二氟-苯基)-4,4-二甲基-4H-噁唑-5-酮 (0.196 g, 0.685 mmol) 溶液。將該反應混合物在 -78°C 下攪拌 15 min 並且在室溫下持續一小時。將該反應藉由添加飽和水性 NH_4Cl 進行淬滅。添加乙酸乙酯 (10 ml) 並且將該等層進行分離。

將水相用乙酸乙酯 (20 ml) 萃取兩次。將有機層進行合併，用水性飽和 NaCl 進行洗滌，用 Na_2SO_4 乾燥。除去溶劑，給出呈黃色油狀物的粗產物。藉由用庚烷/乙酸乙酯 2/1 洗提的矽膠柱快速層析法純化粗產物，以給出呈無色固體的 N-[2-(4-環丙基-苯基)-1,1-二甲基-2-側氧-乙基]-2,6-二氟-苯甲醯胺 (94 mg)。

實施例 P6：三級丁基 N-[2-[4-[2-[(2,6-二氟苯甲醯基)胺基]-2-甲基-丙醯基]苯基]環丙基]胺基甲酸酯 (19.062)

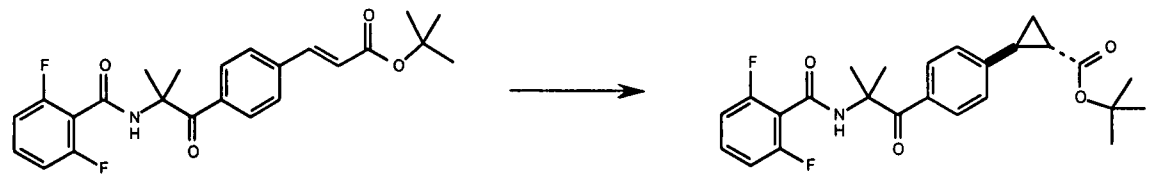
步驟 a：三級丁基(E)-3-[4-[2-[(2,6-二氟苯甲醯基)胺基]-2-甲基-丙醯基]苯基]丙-2-烯酸酯



將二氯甲烷 (200 ml) 放於乾燒瓶中並且藉由引入 10 min 氬氣進行脫氣。在室溫下，添加催化劑 (1,3-雙(2,4,6-三甲基苯基)-2-咪唑啉亞基)二氯(苯基亞甲基)(三環己基磷)鈦 (格布拉斯 (Grubbs) 催化劑，第二代，1.03 g，1.22 mmol)，隨後是三級丁基丙烯酸酯 (9.28 ml，64.0 mmol) 和 N-[1,1-二甲基-2-側氧-2-(4-乙烯基苯基)乙基]-2,6-二氟-苯甲醯胺 (10.8 g，32.8 mmol)。將該溶液在 40°C 下加熱過夜。冷卻後，濾掉該混合物並蒸發母液。使殘餘物進行快速層析，以給出 5.35 g 呈白色固體的標題化合物。Mp: 161°C-2°C。

LCMS (方法D) : 1.10 min, 430 (M+1)⁺。

步驟b：反式-三級丁基-2-[4-[2-[(2,6-二氟苯甲醯基)胺基]-2-甲基-丙醯基]苯基]環丙烷羧酸酯 (19.060)

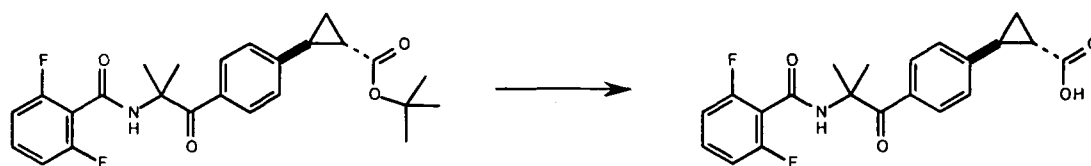


向在 DMSO (50 ml) 中的碘化三甲氧化鎂 (trimethylsulfoxonium iodide) (13.9 g，61.7 mmol) 溶液中添加氫化鈉 (2.47 g；61.7 mmol) 並且將該混合物在室溫下攪拌 1 h。經 10 min，添加溶解於 THF (30 ml) 中的三級丁基 (E)-3-[4-[2-[(2,6-二氟苯甲醯基)胺基]-2-甲基-丙醯基]苯基]丙-2-烯酸酯 (5.30 g，12.3 mmol) 並且將該反應在室溫下攪拌過夜。在用水和鹽水淬滅之後，將該溶液用乙酸乙酯進行萃取。分離有機相並用 MgSO₄ 乾燥。蒸發之後，藉由快速層析法純化殘餘物，以給出呈白色固體的標題化合物。

LC-MS (方法D) : 1.09 min, 444, (M+1)⁺。



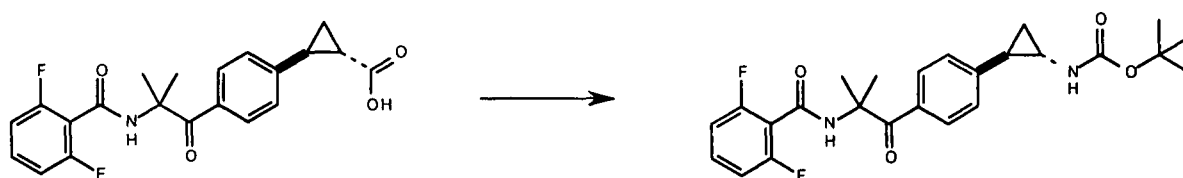
步驟c：反式-2-[4-[2-[(2,6-二氟苯甲醯基)胺基]-2-甲基-丙醯基]苯基]環丙烷羧酸（19.061）



向在二氯甲烷中的三級丁基-2-[4-[2-[(2,6-二氟苯甲醯基)胺基]-2-甲基-丙醯基]苯基]環丙烷羧酸酯（685 mg，1.55 mmol）溶液中添加苯硫酚（0.18 ml，1.70 mmol）和三氟乙酸（5 ml）。2 h 以後，將該反應用飽和 NaHCO_3 溶液淬滅並用乙酸乙酯進行萃取。分離有機相並用 MgSO_4 乾燥。蒸發之後，藉由快速層析法純化殘餘物，以給出呈白色晶體的標題化合物（501 mg）。

LCMS（方法 D）：0.82 min, 386 ($\text{M}+1$)⁺。

步驟 d：反式-三級丁基 N-[2-[4-[2-[(2,6-二氟苯甲醯基)胺基]-2-甲基-丙醯基]苯基]環丙基]胺基甲酸酯（19.062）



將 2-[4-[2-[(2,6-二氟苯甲醯基)胺基]-2-甲基-丙醯基]苯基]環丙烷羧酸（360 mg，0.93 mmol）溶解於三級丁醇中。添加三乙胺（0.39 ml，2.80 mmol）並且在 30 min 後，添加疊氮磷酸二苯酯（dppa，0.22 ml，1.12 mmol）。將該溶液在回流下加熱過夜。冷卻之後，蒸發溶劑並且將殘餘物溶解於乙酸乙酯中。將有機層用水和鹽水洗滌並用 MgSO_4 乾燥。蒸發之後，藉由快速層

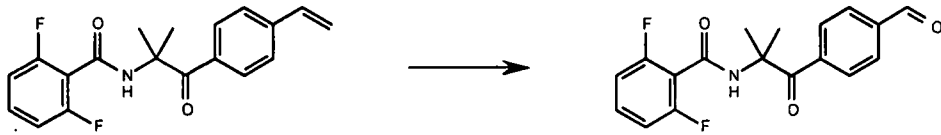
析法純化殘餘物，以給出呈白色晶體的標題化合物（130 mg）。

LCMS（方法 D）：1.00 min, 459 (M+1)⁺。

¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz): 1.10 - 1.29 (m, 2 H), 1.76 (s, 9H), 2.09 (m, 1H), 2.78 (m, 1H), 5.32 (b, 1H), 6.72 (m, 2H), 6.89 (b, 1H), 7.09 (m, 2 H), 7.29 (m, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.89 (s, 1H)。

實施例P7：乙基1-氰基-3-[4-[2-[(2,6-二氟苯甲醯基)胺基]-2-甲基-丙醯基]苯基]-2,2-二甲基-環丙烷羧酸酯（20.001）

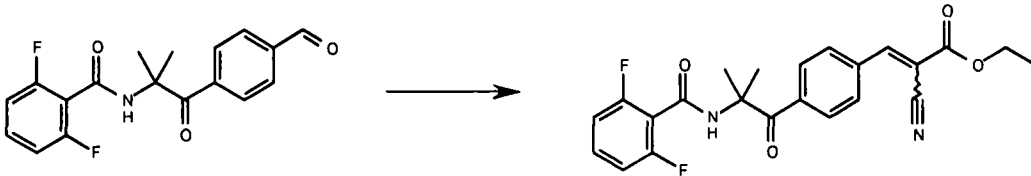
步驟a：2,6-二氟-N-[2-(4-甲醯基苯基)-1,1-二甲基-2-側氧-乙基]苯甲醯胺



在氬氣下，將N-[1,1-二甲基-2-側氧-2-(4-乙炔基苯基)]乙基]-2,6-二氟-苯甲醯胺（10.0 g，30.4 mmol）溶解於CH₂Cl₂中。將該溶液冷卻至-78°C並且向其中吹入臭氧，直到它變為藍色(~2 h)。將該反應用二甲基二硫化物(0.1 ml)淬滅並且加溫至室溫過夜。然後添加三苯基膦（1.0 g，3.77 mmol），以完全還原中間體臭氧化物。濾掉不溶性物質並且蒸發剩餘的溶液。藉由快速層析法純化殘餘物，以給出呈白色晶體的標題化合物（5.67 g）。

LCMS（方法D）：0.84 min, 332 (M+1)⁺。

步驟b：乙基2-氰基-3-[4-[2-[(2,6-二氟苯甲醯基)胺基]-2-甲基-丙醯基]苯基]丙-2-烯酸酯



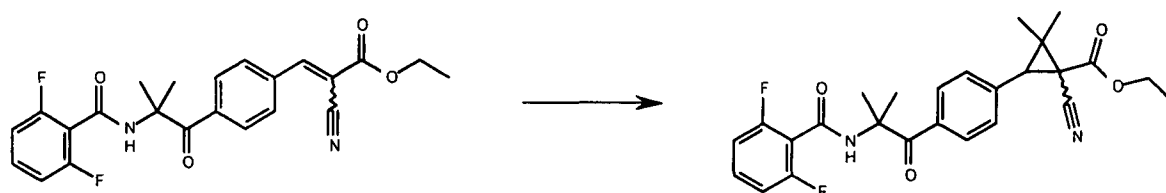
將 2,6-二氟-N-[2-(4-甲醯基苯基)-1,1-二甲基-2-側氧-乙基]苯甲醯胺（300



mg, 0.91 mmol) 溶解於 CH_2Cl_2 (5 ml) 中。向這一溶液中添加硫酸鎂 (0.13 g, 1.07 mmol)、乙酸銨 (0.09 g, 1.11 mmol) 和甲基 2-氰基乙酸酯 (0.11 g, 0.01 mmol)。在室溫下攪拌 4 h 以後，添加 0.11 g 甲基 2-氰基乙酸酯 (1.07 mmol) 和 5 ml 二氯化乙烯。在回流溫度下過夜後，將該混合物傾倒進水中並用 CH_2Cl_2 萃取。將有機相用 MgSO_4 乾燥。蒸發之後，藉由快速層析法純化殘餘物，以給出呈油狀物的標題化合物 (90 mg)。

LCMS (方法 D): 0.98 min, 433 ($\text{M}+1$)⁺。

步驟 c: 乙基 1-氰基-3-[4-[2-[(2,6-二氟苯甲醯基)胺基]-2-甲基-丙醯基]苯基]-2,2-二甲基-環丙烷羧酸酯 (20.001)



根據文獻(例如 D. J. Du Bois(博伊斯)等人 WO 2009/043784, Hoffmann-La Roche (霍夫曼羅氏公司))，向在乙醇 (10 ml) 中的乙基 2-氰基-3-[4-[2-[(2,6-二氟苯甲醯基)胺基]-2-甲基-丙醯基]苯基]丙-2-烯酸酯 (150 mg, 0.36 mmol) 溶液中添加 2-硝基丙烷 (0.034 ml, 0.36 mmol) 和 K_2CO_3 (0.05 g, 0.36 mmol) 並且將該懸浮液在回流下加熱 4 h。將該混合物傾倒進鹽水中並用乙酸乙酯萃取。將有機相用 MgSO_4 乾燥。蒸發之後，藉由快速層析法純化殘餘物，以給出呈油狀物的標題化合物 (31 mg)。

LCMS (方法 D): 1.03 min, 469 ($\text{M}+1$)⁺。

¹H-NMR (CDCl_3 , 400 MHz): 1.38 (t, 3H), 1.49 (s, 3H), 1.58 (s, 3H), 1.81 (s, 6H), 3.29 (s, 1H), 4.32 (q, 2H), 6.81 (s, b, 1H), 6.90 (m, 2H), 7.34 (m, 3H), 7.99 (s, 1H), 8.0 (s, 1H)。

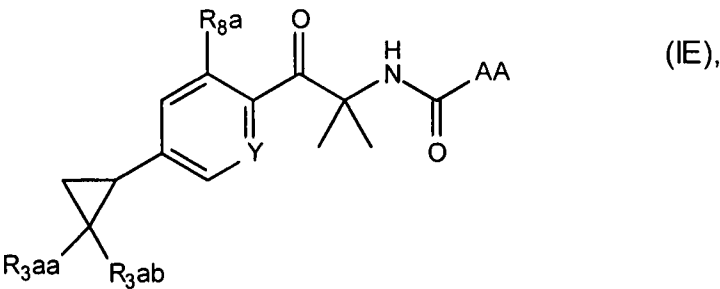
表 19: 表徵數據

表 19 示出了對於本發明的化合物的選擇的熔點、選擇的 HPLC-MS、以及選擇的 NMR 數據。除非另行說明，將 CDCl₃ 用作於 NMR 測量的溶劑。沒有作出在所有情況下列出所有表徵數據的嘗試。

在表 19 以及隨後的整個說明書中，以攝氏度的形式給出溫度；“NMR”係指核磁共振譜；HPLC 係高壓液相層析；MS 代表質譜；“%”係重量百分數，除非相對應的濃度以其他單位標明。整個本說明書使用了以下縮寫：

m.p. =	熔點 [°C]	b.p. =	沸點
S =	單峰	br =	寬鋒
d =	雙峰	dd =	雙二重峰
t =	三重峰	q =	四重峰
M =	多重鋒	ppm =	百萬分之

下表 19 係表徵的具有式 IE 的化合物的列表。



化合物 編號	AA	Y	R8a	R3aa	R3ab	立體化 學	RT (min)	[M+H] ⁺ (測 量的)	LC MS 方法	MP/C
19.001	2,6-二氟苯基	C-H	H	H	H	-	1.73	344	B	121 - 123
19.002	2,6-二氟苯基	C-H	H	Cl	Cl	-	1.87	412/4	A	
19.003	2,6-二氟苯基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋				65 - 82
19.004	2,6-二氟苯基	N	F	H	H	-				127 - 128
19.005	2,6-二氟苯基	C-H	H	CF3	H	S, S				74 - 85
19.006	2,6-二氟苯基	C-H	H	CF3	H	R, R				74 - 85
19.007	2-氟-6-正丁基 苯基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋	1.18	450	D	
19.008	2-氯-吡啶-3-基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋				76 - 77
19.009	2-三氟甲基-吡 啶-3-基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋				148 - 149
19.010	3-氯-吡啶-2-基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋				76 - 77
19.011	2-氯-吡啶-3-基	C-H	H	H	H	-				95 - 96
19.012	2-三氟甲基-吡 啶-3-基	C-H	H	H	H	-				137 - 138
19.013	3-氯-吡啶-2-基	C-H	H	H	H	-	0.97	343/5	D	
19.014	3-氟-吡啶-2-基	C-H	H	H	H	-	0.94	327	D	
19.015	3-氯-吡啶-2-基	C-H	H	H	H	-				121 - 122
19.016	2-三氟甲基-苯 基	C-H	H	H	H	-				156 - 157

化合物 編號	AA	Y	R8a	R3aa	R3ab	立體化 學	RT (min)	[M+H] ⁺ (測 量的)	LC MS 方法	MP/°C
19.017	3-氯-吡啶-2-基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋	1	412/4	D	
19.018	3-氟-吡啶-2-基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋				100 - 101
19.019	2-三氟甲基-苯 基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋				124 - 125
19.020	2-甲氧基-苯基	C-H	H	H	H	-	1.62	338.29	B	
19.021	2-氯-苯基	C-H	H	H	H	-	1.56	342/4	B	
19.022	3-溴-吡啶-2-基	C-H	H	H	H	-	1.49	342/4	B	
19.023	2-甲苯基	C-H	H	H	H	-	1.56	387/9	B	
19.024	2,4,6-三氟苯基	C-H	H	H	H	-	1.56	322	B	
19.025	2-氟苯基	C-H	H	H	H	-	1.57	362	B	
19.026	2-氯, 6-氟苯基	C-H	H	H	H	-	1.56	326	B	
19.027	3-甲基-吡啶-2- 基	C-H	H	H	H	-	1.57	360/2	B	
19.028	2-氟-6-甲氧基 苯基	C-H	H	H	H	-	1.51	323	B	
19.029	2-氟-6-甲苯基	C-H	H	H	H	-	1.58	356	B	
19.030	2,6-二氯苯基	C-H	H	H	H	-	1.62	339	B	
19.031	3,5-二氯-吡啶 -2-基	C-H	H	H	H	-	1.68	376/8	B	
19.032	2-氯-1-側氧-吡 啶-6-基	C-H	H	H	H	-	1.50	377/9	B	



化合物 編號	AA	Y	R8a	R3aa	R3ab	立體 化學	RT (min)	[M+H] ⁺ (測 量的)	LC MS 方法	MP/°C
19.033	3-6-二氯-吡啶 -2-基	C-H	H	H	H	-	1.65	359/61	B	
19.034	3-氯-5-三氟甲 基-吡啶-2-基	C-H	H	H	H	-	1.74	377/9	B	
19.035	3-氟-5-氯-吡啶 -2-基	C-H	H	H	H	-	1.63	410/12	B	
19.036	2-溴苯基	C-H	H	H	H	-	1.58	361/3	B	
19.037	2-甲基-吡啶-3- 基	C-H	H	H	H	-	1.04	386/8	B	
19.038	3-甲氧基-吡啶 -2-基	C-H	H	H	H	-	1.33	323	B	
19.039	2-三氟甲基硫 烷基-苯基	C-H	H	H	H	-	1.76	339	B	
19.040	2-氟-6-三氟甲 基-苯基	C-H	H	H	H	-	1.64	394	B	
19.041	2-甲苯基	C-H	H	CF3	H	反式，外 消旋	1.70	390	B	
19.042	2,4,6-三氟苯基	C-H	H	CF3	H	反式，外 消旋	1.69	430	B	
19.043	2-氟苯基	C-H	H	CF3	H	反式，外 消旋	1.69	394	B	
19.044	2-氯-6-氟苯基	C-H	H	CF3	H	反式，外 消旋	1.69	428/30	B	

化合物 編號	AA	Y	R8a	R3aa	R3ab	立體化 學	RT (min)	[M+H] ⁺ (測 量的)	LC MS 方法	MP/°C
19.045	3-甲基-吡啶-2 基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋	1.70	391	B	
19.046	2-氟-6-甲氧基- 苯基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋	1.64	424	B	
19.047	2,6-二氯苯基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋	1.74	444/6	B	
19.048	3,5-二氯-吡啶 -2-基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋	1.79	445/7	B	
19.049	2-氯-1-側氧-吡 啶-6-基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋	1.64	427/9	B	
19.050	3,6-二氯-吡啶 -2-基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋	1.76	445/7	B	
19.051	3-氯-5-三氟甲 基-吡啶-2-基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋	1.83	479/81	B	
19.052	5-氯-3-氟-吡啶 -2-基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋	1.75	429/31	B	
19.053	2-甲基-吡啶-3- 基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋	1.25	391	B	
19.054	3-甲氧基-吡啶 -2-基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋	1.49	407	B	
19.055	2-三氟甲基硫 烷基-苯基	C-H	H	CF3	H	反式, 外 消旋	1.85	476	B	

化合物 編號	AA	Y	R8a	R3aa	R3ab	立體化 學	RT (min)	[M+H] ⁺ (測 量的)	LC MS 方法	MP/°C
19.056	2-甲氧基-苯基	C-H	H	CF3	H	反式，外 消旋	1.74	406	B	
19.057	2-氯苯基	C-H	H	CF3	H	反式，外 消旋	1.69	410/12	B	
19.058	2-氟基苯基	C-H	H	CF3	H	反式，外 消旋	1.55	401	B	
19.059	3-溴-吡啶-2-基	C-H	H	CF3	H	反式，外 消旋	1.63	455/7	B	
19.060	2,6-二氟苯基	C-H	H	CO2tBu	H	反式，外 消旋	1.07	444	D	
19.061	2,6-二氟苯基	C-H	H	COOH	H	反式，外 消旋				115 - 116
19.062	2,6-二氟苯基	C-H	H	NHBOC	H	反式，外 消旋				197 - 198
19.063	2,6-二氟苯基	C-H	H	CONHMe	H	反式，外 消旋				129 - 130
19.064	2,6-二氟苯基	C-H	H	NO2	H	反式，外 消旋	0.93	389	D	

在表 19 和 20 中，‘立體化學 (Stereo)’ 係指附接至 R3aa/R3ab 和苯基/吡啶環的環丙基的碳原子的立體化學，即

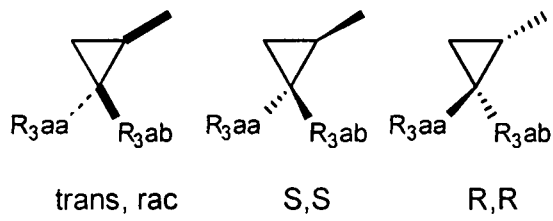
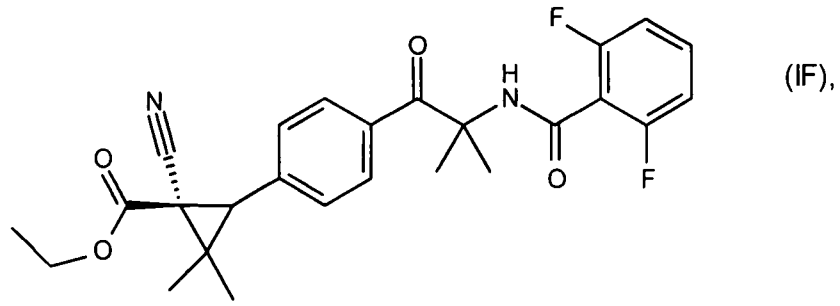


表 20 包含另一種表徵的具有式 (IF) 之化合物 20.001



化合物編號	RT (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	LC MS 方法
20.001	1.08	469	D

生物學實施例：

甜菜胞囊線蟲 (*Heterodera schachtii*) (甜菜囊胞線蟲)，

殺線蟲劑，接觸活性。

每個化合物的測試施用量係 200 ppm。使得所有溶液的濃度均分別為 400 ppm，它們被隨後藉由添加等量的包含線蟲幼蟲的水來稀釋。在製備懸浮液以後，將 1 ml 的每種懸浮液和濃縮物轉移至 16 孔測定板上，每個處理總共三個重複。向每個孔中添加在 1 ml 的水中的大約 500 隻甜菜胞囊線蟲幼蟲。水中的幼蟲作為對照。將該等平板放置在暗箱中並且在室溫下存儲。在黑暗中，在 25°C 下培養 24 小時以後，確定線蟲麻痹。不顯示出運動的線蟲被認為是不能移動的。



與未處理的對照相比，以下該等化合物顯示出大於 75% 的線蟲固定化：

19.001、19.003、19.004、19.005、19.006、19.007、19.008、19.009、19.010、
19.011、19.012、19.014、19.015、19.017、19.018、19.019、19.020、19.021、
19.022、19.023、19.024、19.025、19.026、19.027、19.028、19.029、19.033、
19.036、19.037、19.038、19.041、19.042、19.043、19.044、19.045、19.046、
19.053、19.054、19.056、19.057、19.059、19.060、19.062、19.064。

根結線蟲屬 (*Meloidogyne spp.*) (根癌線蟲)

殺線蟲劑，接觸活性，預防性。

將具有小口袋的濾紙 (9 cm x 4.5 cm) 放於塑膠製品 (12 cm x 6 cm) 中。將黃瓜品種托斯卡 (toshka) 的種子放置在針對測試所需的所有小袋的濾紙口袋中間。將該等小袋中的黃瓜種子用處於 200 ppm 的測試溶液，藉由移液管直接將該溶液滴在小袋中濾紙袋內的黃瓜種子上進行處理。施用之前，製備所要求濃度兩倍的該化合物溶液並且用具有 3000 卵/0.5 ml 的 FORL 營養液製備卵懸浮液。施用所有的處理之後，將 3000 卵 (在 0.5 ml 的 FORL 營養液中) 用移液管吸取到該等小袋中。將該等小袋在保濕室中培養十二天並且定期澆水以保持用於生長黃瓜根系必須的、良好的濾紙水分。這個時期之後，將包含該萌發的黃瓜幼苗的濾紙從該塑膠小袋中取出，以評估每個根系由根結線蟲屬引起的蟲癭的數量。與對照相比，將植物毒性測量為出苗的黃瓜秧苗的生長的減少。

與未處理的對照相比，以下該等化合物顯示出大於 80% 的蟲癭的減少：

19.003、19.005、19.006、19.008、19.010、19.015、19.017、19.018、19.019、
19.060、19.064。

根結線蟲屬 (根癌線蟲)

殺線蟲劑，接觸活性，預防性

將黃瓜品種托斯卡 (Toshka) 的種子直接播種在填充有砂土基質的花盆

中。六天之後，將該等花盆每個用測試化合物的 5 ml 的 WP10 懸浮液進行處理。此後，用南方根結線蟲的 3000 卵接種該等花盆。試驗性施用並接種十四天之後，獲得試驗結果。根據 Zeck's gall index(塞克氏癭索引)(Zeck W.M. (塞克 W.M.) (1971) Ein Bonitierungsschema zur Felddauswertung von Wurzelgallenbefall. Pflanzenschutznachrichten Bayer 24,1: 144-147.) 對根癭進行評估。與對照相比，將植物毒性測量為出苗的黃瓜秧苗的生長的減少。

與未處理的對照相比，以下該等化合物顯示出大於 80% 的蟲癭的減少：

19.001、19.003、19.004、19.005、19.006、19.008、19.009、19.010、19.011、19.012、19.013、19.014、19.015、19.017、19.018、19.064。

根結線蟲屬（根癌線蟲）

殺線蟲劑，接觸活性，預防性

將包衣的番茄品種 Roter Gnom 種子播種於被田間土壤填充的 45 ml 盆中，播種深度 0.5 至 1 cm。然後，藉由向種子頂部移液在 2 ml 懸浮液中的 2000 個根結線蟲屬卵來用線蟲侵染盆。此後，將種孔用土壤進行填充。評估植物毒性（以%）並且接種之後 28 天出現根癭。將根進行洗滌，不含土壤殘渣並且根據 Zeck（塞克）1971 以從 0 至 7 的級別對癭指數進行評估。

種子處理率：1 mg AI/種子

與未處理的對照相比，以下該等化合物顯示出大於 80% 的蟲癭的減少：

19.003、19.005、19.008、19.010、19.017、19.059。

甜菜胞囊線蟲（甜菜囊胞線蟲）

殺線蟲劑，接觸活性，預防性

將包衣的甜菜品種 Impulse 種子種植於填充有田間土壤的 45 ml 盆中。在播種之後若干天，將盆用在 2 ml 懸浮液中的 500 隻 J2 甜菜胞囊線蟲在秧苗的左邊和右邊的兩個孔中進行侵染。對接種之後 10 天出現的每 g 根的線蟲數目進行評估。切除植物的上部分並且將該等根進行洗滌，不含土壤殘

渣。將根內的線蟲用酸性品紅染色液進行染色。在 40 x 解剖視野下，對根內的線蟲進行量化。

種子處理率：0.6 mg AI/種子

與未處理的對照相比，以下該等化合物顯示出大於 80%的線蟲群體的減少：

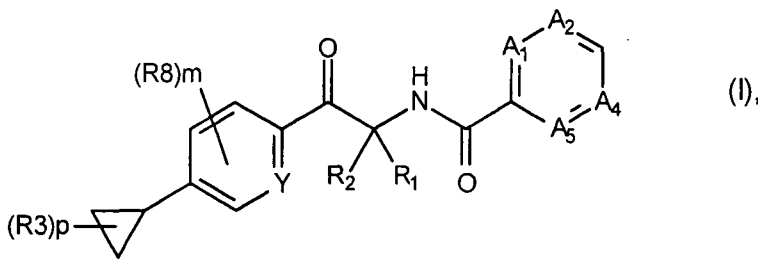
19.003、19.008、19.010、19.015、19.017。

【符號說明】

無

申請專利範圍

1. 一種具有式 I 之化合物，



其中

Y 係 C-H、C-F、C-Cl 或 N，

A1、A2、A4 和 A5 彼此獨立地是 N、CH 或 CR6，

其中在包含 A1、A2、A4 和 A5 的環中的 N 原子的數目係 0、1 或 2，

R6 彼此獨立地選自鹵素、氰基、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、C1-C4-烷氧基、以及 C1-C4-鹵代烷氧基，

R1 和 R2 各自是甲基，或 R1 和 R2 與其附接至其上的碳原子一起形成環丙基或環丁基環，

R3 彼此獨立地選自鹵素、氰基、R9、O-R9、NO2、COOR9、CONHR9、CONR9aR9、NHR9、NR9aR9、以及 NHCOR9，

R8 彼此獨立地選自鹵素、氰基、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、C1-C4-烷氧基、以及 C1-C4-鹵代烷氧基，

R9 和 R9a 彼此獨立地選自未取代的或被一個或多個 R10 取代的 C1-C4-烷基、未取代的或被一個或多個 R10 取代的 C2-C6-烯基、未取代的或被一個或多個 R10 取代的 C2-C6-炔基、未取代的或被一個或多個 R10 取代的芳基、或未取代的或被一個或多個 R10 取代的雜芳基，

R10 彼此獨立地選自鹵素、氰基、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、C1-C4-烷氧基、以及 C1-C4-鹵代烷氧基，

p 係 0 至 4，

m 係 0 至 3，

以及該等化合物的互變異構物/同分異構物/非鏡像異構物/鏡像異構物。

2. 如申請專利範圍第 1 項所述之化合物，其中 R1 和 R2 各自是甲基，或 R1 和 R2 與其附接至其上的碳原子一起形成環丙基或環丁基環。

3. 如申請專利範圍第 1 項或申請專利範圍第 2 項所述之化合物，其中 Y 係 C-H 或 N。

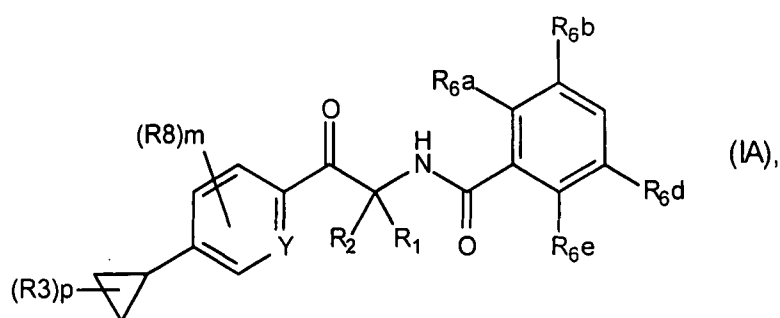
4. 如申請專利範圍第 1 項或申請專利範圍第 2 項所述之化合物，其中 R3 彼此獨立地選自鹵素、氰基、C1-C2-烷基以及 C1-C2-鹵代烷基。

5. 如申請專利範圍第 1 項或申請專利範圍第 2 項所述之化合物，其中 R8 獨立地選自鹵素、氰基、C1-C2-烷基、或 C1-C2-鹵代烷基。

6. 如申請專利範圍第 1 項或申請專利範圍第 2 項所述之化合物，其中 p 係 0、1 或 2。

7. 如申請專利範圍第 1 項或申請專利範圍第 2 項所述之化合物，其中 m 係 0 或 1。

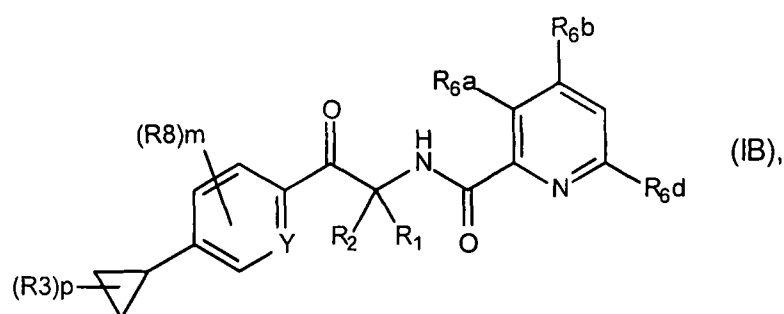
8. 一種具有式 IA 之化合物，



其中 R1、R2、R3、R8、Y、m 以及 p 係如對於申請專利範圍第 1 至 7 項中任一項中的式 (I) 所定義的，並且 R6a、R6b、R6d 以及 R6e 獨立地選自氫、鹵素、氰基、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、C1-C4-烷氧基、以及 C1-C4-

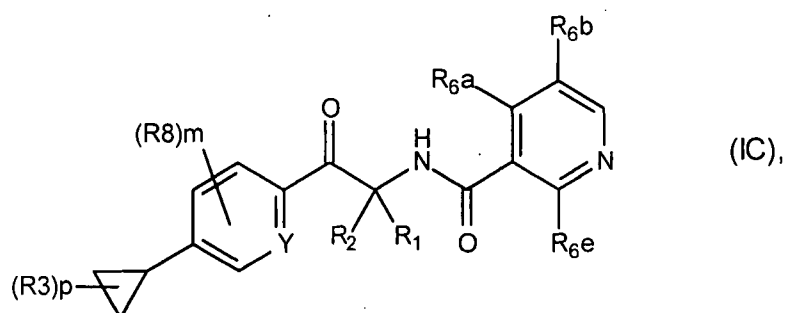
鹵代烷氧基。

9. 一種具有式 IB 之化合物，



其中 R1、R2、R3、R8、Y、m 以及 p 係如對於申請專利範圍第 1 至 7 項中任一項中的式 (I) 所定義的，並且 R6a、R6b、以及 R6d 獨立地選自氫、鹵素、氰基、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、C1-C4-烷氧基、以及 C1-C4-鹵代烷氧基。

10. 一種具有式 IC 之化合物，



其中 R1、R2、R3、R8、Y、m 以及 p 係如對於申請專利範圍第 1 至 7 項中任一項中的式 (I) 所定義的，並且 R6a、R6b、以及 R6e 獨立地選自氫、鹵素、氰基、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、C1-C4-烷氧基、以及 C1-C4-鹵代烷氧基。

11. 一種殺有害生物組合物，其除包括配製物佐劑之外，還包括殺線蟲有效量的、如申請專利範圍第 1 至 10 項中任一項所述之化合物。

12. 如申請專利範圍第 11 項所述之組合物，其進一步包括一種或多種殺昆蟲、殺蟎、殺線蟲和/或殺真菌之活性劑。

13. 一種用於控制由有害生物和/或真菌（特別是線蟲）導致的損害和/或產量損失之方法，該方法包括向有害生物、向有害生物的場所、或向易受有害生物和/或真菌攻擊的植物或向植物繁殖材料施用有效量的如在申請專利範圍第 1 至 10 項中任一項所定義的具有式 (I) 之化合物或在申請專利範圍第 11 或 12 項中任一項所定義之組合物。

14. 一種用於保護植物繁殖材料不受由有害生物和/或真菌（特別是線蟲）導致的損害和/或產量損失之方法，該方法包括向該植物繁殖材料或該植物繁殖材料種植的場所施用有效量的如在申請專利範圍第 1 至 10 項中任一項所定義的具有式 (I) 之化合物或在申請專利範圍第 11 或 12 項中任一項所定義的組合物。

15. 如申請專利範圍第 13 項或申請專利範圍第 14 項所述之方法，其中該損害或損失係由線蟲有害生物導致。

16. 一種經處理的植物繁殖材料，其中附著在該植物繁殖材料上的是有效量的如在申請專利範圍第 1 至 10 項中任一項所定義的具有式 (I) 之化合物。

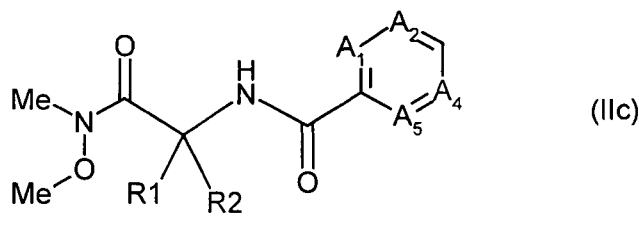
17. 一種用於控制蠕蟲、蛛形綱或節肢動物體內-或體外寄生蟲之藥用組合物，該藥用組合物包括如在申請專利範圍第 1 至 10 項中任一項所定義的具有式 (I) 之化合物，生理學上可容許的載體以及任選地一種或多種常規的配製物助劑。

18. 一種藥用組合物，其包括如在申請專利範圍第 1 至 10 項中任一項所定義之化合物，生理學上可容許的載體，以及任選地一種或多種常規的配製物助劑，該藥用組合物用於防止藉由蠕蟲、蛛形綱或節肢動物體內-或體外寄生蟲傳播的疾病之感染。

19. 如申請專利範圍第 17 或 18 項中任一項所述之組合物，其進一步包括一種或多種其他生物活性化合物。

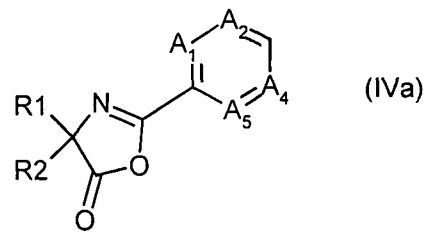
20. 一種如申請專利範圍第 17 至 19 項中任一項所述之組合物之用途，其係用於製備用以控制或防止溫血動物中的體內-和體外寄生的線蟲侵染及感染之醫藥品，其中該醫藥品係以包括注射、局部施用或經口給予該醫藥品的方法使用。

21. 一種具有式 IIc 之化合物，



其中 A1、A2、A4 和 A5 彼此獨立地是 N、CH 或 CR6，
其中在包含 A1、A2、A4 和 A5 的環中的 N 原子的數目係 0、1 或 2，
R6 彼此獨立地是鹵素、氰基、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、C1-C4-烷氧基、或 C1-C4-鹵代烷氧基並且 R1 和 R2 係如在申請專利範圍第 1 或 2 項中所定義的；其條件係當 A1 係 CH 或 C-CH3 時，A4 和 A5 中至少一者係 N 或 CR6。

22. 一種具有式 IVa 之化合物，

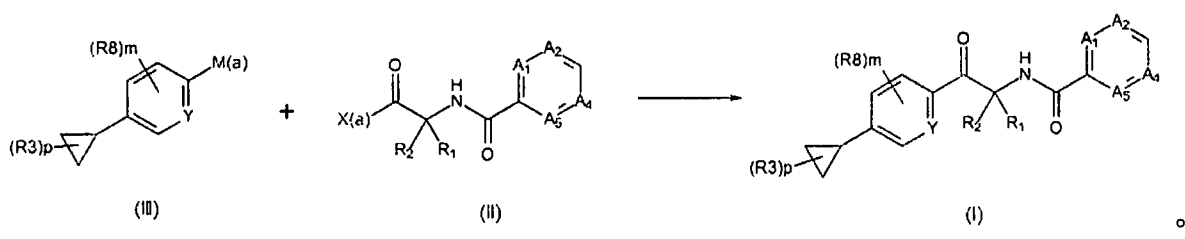


其中 A1、A2、A4 和 A5 彼此獨立地是 N、CH 或 CR6，其中在包含 A1、A2、A4 和 A5 的環中的 N 原子的數目係 0、1 或 2，R6 彼此獨立地是鹵素、氰基、C1-C4-烷基、C1-C4-鹵代烷基、C1-C4-烷氧基、或 C1-C4-鹵代烷氧基，並且 R1 和 R2 係如在申請專利範圍第 1 或 2 項中所定義；其條件係當 A1

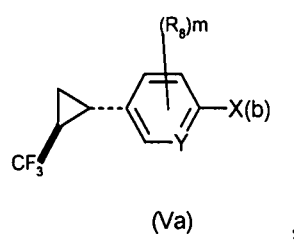


係 CH 或 C-C1-C4-烷基時，A2、A4 和 A5 中至少一者係 N 或 CR6。

23. 一種用於製備具有式 I 化合物之方法，該方法係藉由將具有式 III 之有機金屬化合物與具有式 II 之羧酸衍生物在溶劑中持續在 10 分鐘至 5 小時之間並且在 -80°C 至 25°C 之間的醃化，在該具有式 III 之有機金屬化合物中 R3、p、R8、m 以及 Y 係如在申請專利範圍第 1 和 3 至 6 項的任一項中在式 I 下所定義的，並且 M(a)係金屬，在該具有式 II 之羧酸衍生物中 A1、A2、A4、A5、R1 以及 R2 係如在申請專利範圍第 1 項或申請專利範圍第 2 項中所定義的，並且 X(a)係 C1-C6 烷氧基、雜-取代的-C1-C6 烷氧基或雜原子-取代的二烷基胺基

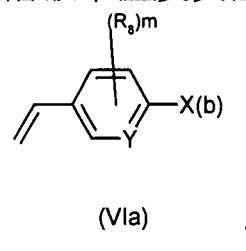


24. 一種用於製備具有式 Va 的化合物之方法，



其中 R8、m、和 Y 係如在申請專利範圍第 1、3、5 和 7 項的任一項中所定義並且 X(b)係鹵素，

該方法包括向 2,2,2-三氟乙胺鹽、具有式 VIa 的化合物以及金屬催化劑的水溶液中溫度受控地添加亞硝酸鈉的水溶液



其中該亞硝酸鈉溶液以這樣的方式添加使得反應溫度被保持在 0°C 與 100°C 之間。