201609674

(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本 (11)公開編號：TW 201609674 A

(43)公開日： 中華民國 105 (2016) 年 03 月 16 日

(21)申請案號：103138399 (22)申請日： 中華民國 103 (2014) 年 11 月 05 日

(51)Int. Cl.： *C07D249/06 (2006.01)* *C07D401/04 (2006.01)*
C07D409/12 (2006.01) *A01N43/647 (2006.01)*
A01P7/00 (2006.01) *A61K31/4192 (2006.01)*
A61K31/4439 (2006.01) *A61P33/14 (2006.01)*

(30)優先權：2013/11/05 歐洲專利局 13191612.4

(71)申請人：拜耳作物科學股份有限公司 (德國) BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT (DE)
德國

(72)發明人：哈倫巴其 溫納 HALLENBACH, WERNER (DE)；高詹斯 烏利奇 GOERGENS, ULRICH (DE)；托伯格 安卓斯 TURBERG, ANDREAS (DE)；伊格 克斯汀 ILG, KERSTIN (DE)；霍斯特曼 賽巴斯欽 HORSTMANN, SEBASTIAN (DE)；柯柏霖 約翰拿斯 KOEBBERLING, JOHANNES (DE)

(74)代理人：林秋琴；陳彥希

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：15 項 圖式數：0 共 123 頁

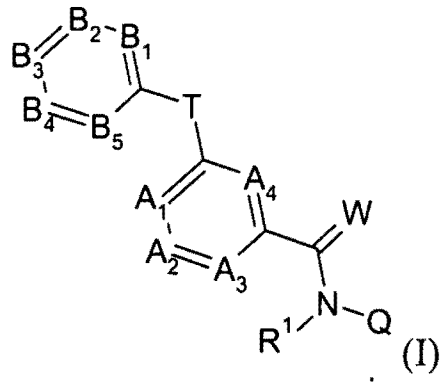
(54)名稱

用於控制節肢動物的新穎化合物（二）

NOVEL COMPOUNDS FOR CONTROLLING ARTHROPODS

(57)摘要

本發明特別關於新穎之通式(I)化合物

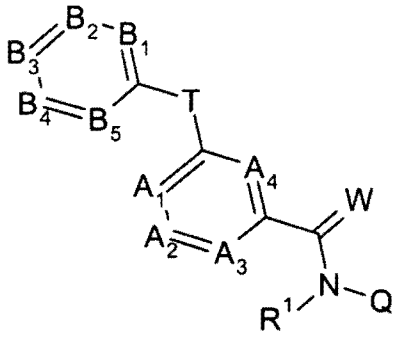


(I)

其中 A_1-A_4、T、W、Q、R^1 及 B_1-B_4 殘基各如本說明書中所定義者。亦說明用於製備該式(I)化合物之方法。本發明之化合物尤其適合於農業中用來控制昆蟲類、蜘蛛類及線蟲類，及於獸醫用藥中控制外寄生蟲。

The invention relates inter alia to novel compounds of the general formula (I)

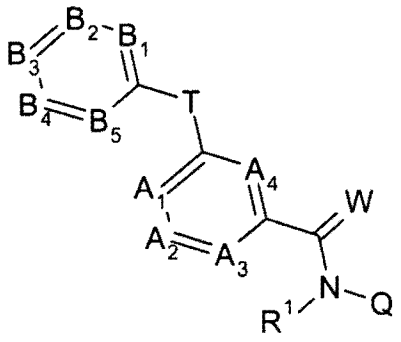
TW 201609674 A



(I)

in which the A_1-A_4, T, W, Q, R^1 and B_1-B_4 radicals are each as defined in the description. Also described are processes for preparing the compounds of the formula (I). The inventive compounds are especially suitable for controlling insects, arachnids and nematodes in agriculture, and ectoparasites in veterinary medicine.

特徵化學式：



(I)

201609674

發明摘要

※ 申請案號：103138399

※ 申請日：103.11.5

※IPC 分類：C07D 249/06 (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)
C07D 409/12 (2006.01)
A01N 43/647 (2006.01)
A01P 7/00 (2006.01)
A61K 31/4192 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01)
A61P 33/14 (2006.01)

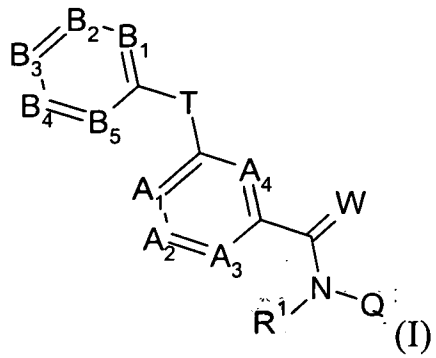
【發明名稱】(中文/英文)

用於控制節肢動物的新穎化合物(二)

NOVEL COMPOUNDS FOR CONTROLLING ARTHROPODS

【中文】

本發明特別關於新穎之通式(I)化合物

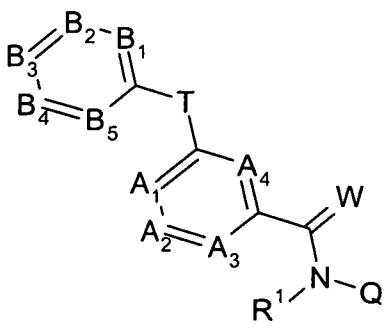


(I)

其中 A_1-A_4、T、W、Q、R^1 及 B_1-B_4 殘基各如本說明書中所定義者。亦說明用於製備該式(I)化合物之方法。本發明之化合物尤其適合於農業中用來控制昆蟲類、蜘蛛類及線蟲類，及於獸醫用藥中控制外寄生蟲。

【英文】

The invention relates *inter alia* to novel compounds of the general formula (I)



(I)

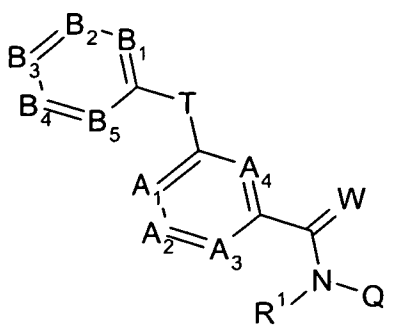
in which the A_1-A_4, T, W, Q, R^1 and B_1-B_4 radicals are each as defined in the description. Also described are processes for preparing the compounds of the formula (I). The inventive compounds are especially suitable for controlling insects, arachnids and nematodes in agriculture, and ectoparasites in veterinary medicine.

【代表圖】

【本案指定代表圖】： 無

【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】：



(I)

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）

用於控制節肢動物的新穎化合物(二)

NOVEL COMPOUNDS FOR CONTROLLING ARTHROPODS

【技術領域】

【0001】 本申請案係關於新穎之化合物，關於其製備之方法，及關於其用於控制動物害蟲，特別是節肢動物且尤其昆蟲類、蜘蛛類及線蟲類之用途。

【先前技術】

【0002】 特定經鹵素取代之化合物具有殺昆蟲活性係已知(EP 1 911 751、WO2012/069366、WO2012/080376、WO2012/107434 及 WO2012/175474)。

【0003】 WO 2011/113756 揭示具有殺昆蟲活性之三唑衍生物。

【0004】 亦已知特定經鹵素取代之化合物具有細胞素抑制之活性(WO 2000/07980)。

【0005】 現代作物保護組成物必須滿足許多要求，例如關於效益、持久性與作用譜，及可能之用途。毒性及與其他活性組成份或配製物助劑組合性之問題，於合成活性組成份所需費用之問題上扮演一個角色。此外，可能發生抗藥性。由於所有此等理由，尋找新穎之作物保護劑永遠不被認為已經完成，且不斷需要具有改良特性至少於個別方面超過已知化合物之新穎化合物。

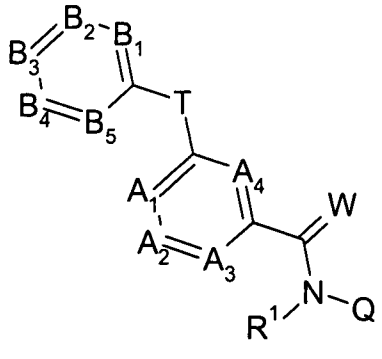
【0006】 本發明之目的係提供農藥譜能於各方面擴展及/或改善其活性之化合物。

【0007】 令人驚奇地，現今已發現特定經鹵素取代之化合物及其鹽具有生物特性且尤其適合於農用化學品領域中及於動物健康領域中用來控制動物害蟲，且因此具有特別良好的可用性。

【0008】 類似之化合物業已知於 WO 2010/051926。

【發明內容】

【0009】 具有殺昆蟲、殺蠕蟲及/或殺寄生蟲活性且為通式(I)之新穎化合物業已發現：



(I)

其中

R^1 為 H、於每一情況中任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-炔基、C_3-C_7-環烷基、C_1-C_6-烷基羰基、C_1-C_6-烷氧基羰基、芳基(C_1-C_3)-烷基、雜芳基(C_1-C_3)-烷基，

下列之部分如下：

A_1 為 CR^2 或 N，

A_2 為 CR^3 或 N，

A_3 為 CR^4 或 N，

A_4 為 CR^5 或 N，

B_1 為 CR^6 或 N，

B_2 為 CR^7 或 N，

B_3 為 CR^8 或 N，

B_4 為 CR^9 或 N，且

B_5 為 CR^{10} 或 N，

但 A_1 至 A_4 部分中不超過 3 個為 N 且 B_1 至 B_5 部分中不超過 3 個為 N；

R^2、R^3、R^4、R^5、R^6、R^7、R^9 及 R^{10} 各自獨立為 H、鹵素、氰基、硝基、於每一情況中任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_3-C_6-環烷基、C_1-C_6-烷氧基、N-C_1-C_6-烷氧基亞胺基-C_1-C_3-烷基、C_1-C_6-烷基硫烷基、C_1-C_6-烷基亞磺醯、C_1-C_6-烷基磺醯、N-C_1-C_6-烷基胺基或 N,N-

二-C_1-C_6-烷基胺基；

若沒有 A_2 及 A_3 部分為 N，則 R^3 及 R^4 與其等所結合之碳原子一起可形成含有 0、1 或 2 個氮原子及/或 0 或 1 個氧原子及/或 0 或 1 個硫原子之 5-或 6-員環，或

若沒有 A_1 及 A_2 部分為 N，則 R^2 及 R^3 與其等所結合之碳原子一起可形成含有 0、1 或 2 個氮原子之 6-員環；

R^8 為鹵素、氰基、硝基、於每一情況中任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_3-C_6-環烷基、C_1-C_6-烷氧基、N-C_1-C_6-烷氧基亞胺基-C_1-C_3-烷基、C_1-C_6-烷基硫烷基、C_1-C_6-烷基亞磺醯、C_1-C_6-烷基磺醯、N-C_1-C_6-烷基胺基或 N,N-二-C_1-C_6-烷基胺基；

W 為 O 或 S；

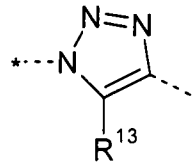
Q 為 H、甲醯基、羥基、胺基或於每一情況中任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-炔基、C_3-C_6-環烷基、C_1-C_5-雜環烷基、C_1-C_4-烷氧基、C_1-C_6-烷基-C_3-C_6-環烷基、C_3-C_6-環烷基-C_1-C_6-烷基、C_6-,C_{10}-C_{14}-芳基、C_1-C_5-雜芳基、C_6-,C_{10}-,C_{14}-芳基-C_1-C_3-烷基、C_1-C_5-雜芳基-C_1-C_3-烷基、N-C_1-C_4-烷基胺基、N-C_1-C_4-烷基羰基胺基，或 N,N-二-C_1-C_4-烷基胺基；或

為任意多-V-取代之不飽和 6-員碳環；或

為任意多-V-取代之不飽和 5-或 6-員雜環，其中，

V 獨立為鹵素、氰基、硝基、於每一情況中任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_1-C_4-烯基、C_1-C_4-炔基、C_3-C_6-環烷基、C_1-C_6-烷氧基、N-C_1-C_6-烷氧基亞胺基-C_1-C_3-烷基、C_1-C_6-烷基硫烷基、C_1-C_6-烷基亞磺醯、C_1-C_6-烷基磺醯，或 N,N-二-(C_1-C_6-烷基)胺基；

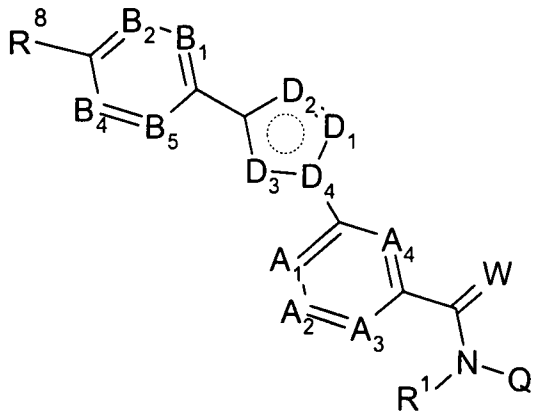
T 為含有 3 個雜原子，較佳選自於基團包括 N、O 及 S，於每一情況中任意經取代之 5-員雜芳族；



於 T 不為 之條件下，

其中，R^{13} 為 H、鹵素、C_1-C_4-烷基、鹵素取代之 C_1-C_6-烷基或氰基；及式(I)化合物之鹽、N-氧化物及互變異構體形式。

【0010】 本發明之一個具體例係關於以式(Ia)說明之式(I)化合物：



(Ia)

其中

D_1、D_2及 D_3各自獨立為 C-R^{11}或雜原子，較佳 C-R^{11}或雜原子選自於 N、O 或 S；且

D_4 為 C 或選自於 N 之雜原子(亦即為 C 或 N)；

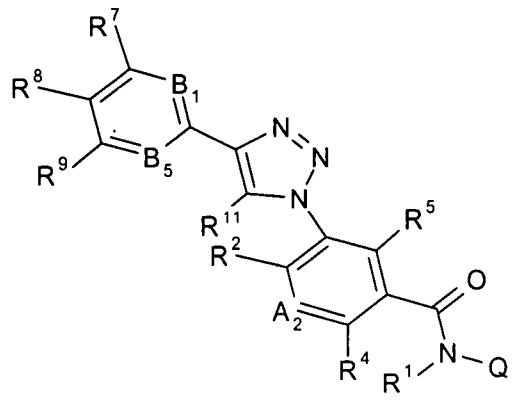
其中選自於 D_1、D_2、D_3及 D_4之 3 個部分為雜原子；

R^{11} 獨立為 H、鹵素、氰基、硝基、胺基或於每一情況中任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷基氧基、C_1-C_6-烷基羰基、C_1-C_6-烷基硫烷基、C_1-C_6-烷基亞磺醯、C_1-C_6-烷基磺醯，較佳為 H，

◌ 為芳族系；且

R^1、Q、W、A_1、A_2、A_3、A_4、B_1、B_2、B_3、B_4及 B_5係各自如申請專利範圍第 1 項中所定義者，其中，選自於 A_1、A_2、A_3、A_4中不超過 1 個部分為 N 且選自於 B_1、B_2、B_3、B_4及 B_5中不超過 1 個部分為 N。

【0011】 本發明之進一步具體例係關於以式(Ie)化合物說明之式(I)化合物，



(Ie)

其中，R^1、R^2、R^4、R^5、R^7、R^8、R^9、R^{10}、R^{11}、Q、A_2、B_1及 B_5

各自定義如本文中所說明者。

【0012】 還有本發明之另一具體例係關於本文中所說明之式化合物，其中 R^{11} 獨立為 H。

【0013】 還有本發明之另一具體例係關於本文中所說明之式化合物，其中 R^6、R^7、R^9 及 R^{10} 各自獨立為 H、鹵素、氰基、硝基、於每一情況中任意經取代之 C_1-C_4-烷基、C_3-C_4-環烷基、C_1-C_4-烷氧基、N-烷氧基亞胺基烷基、C_1-C_4-烷基硫烷基、C_1-C_4-烷基亞磺醯、C_1-C_4-烷基磺醯、N-C_1-C_4-烷基胺基、N,N-二-C_1-C_4-烷基胺基。

【0014】 還有本發明之另一具體例係關於本文中所說明之式化合物，其中 R^2、R^3、R^4 及 R^5 各自獨立為 H、鹵素、氰基、硝基、於每一情況中任意經取代之 C_1-C_4-烷基、C_3-C_4-環烷基、C_1-C_4-烷氧基、N-C_1-C_4-烷氧基亞胺基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷基硫烷基、C_1-C_4-烷基亞磺醯、C_1-C_4-烷基磺醯、N-C_1-C_4-烷基胺基或 N,N-二-C_1-C_4-烷基胺基。

【0015】 還有本發明之另一具體例係關於本文中所說明之式化合物，其中 A_1 至 A_4 及 B_1 至 B_5 部分如下：

A_1 為 C-H，

A_2 為 CR^3 或 N，

A_3 為 CR^4，

A_4 為 C-H，

B_1 為 CR^6 或 N，

B_2 為 C-H，

B_3 為 CR^8，

B_4 為 C-H 且

B_5 為 CR^{10} 或 N。

【0016】 還有本發明之另一具體例係關於本文中所說明之式化合物，其中 R^1 為 H。

【0017】 還有本發明之另一具體例係關於本文中所說明之式化合物，其中 Q 為氟取代之 C_1-C_4-烷基、C_3-C_4-環烷基、任意經氰基或氟取代之 C_3-C_4-環烷基、C_4-C_6-雜環烷基、1-氧撐噻坦-3-基、1,1-二氧撐噻坦-3-基、苄基。

5

【0018】 還有本發明之另一具體例係關於本文中所說明之式化合物，其中 Q 為 2,2,2-三氟乙基、2,2-二氟乙基、3,3,3-三氟丙基、環丙基、環丁基、環丙基、環丁基、1-氰基環丙基、反式-2-氟環丙基，或順式-2-氟環丙基、喔坦(oxetan)-3-基、噻坦-3-基、1-氧撐噻坦-3-基、1,1-二氧撐噻坦-3-基、苄基、吡啶-2-基甲基、甲基磺醯或 2-酮基-2-(2,2,2-三氟乙基胺基)乙基。

【0019】 還有本發明之另一具體例係關於本文中所說明之式化合物，其中 R^8 為鹵素或經鹵素取代之 C_1-C_4-烷基，例如全氟代甲基、全氟代乙基或全氟代丙基。於一個具體例中，R^8 較佳為全氟代丙基。

【0020】 另一方面係關於殺昆蟲組成物，其特徵在於含有至少一種式(I)化合物如本文中所說明者及增充劑及/或表面活性物質。

【0021】 另一方面係關於用於保護基因轉殖或習用種子及由此產生之植物免於害蟲侵襲之方法，其特徵在於該種子係用至少一種式(I)化合物如本文中所說明者處理。

【0022】 還有另一方面係關於如本文中所說明之式(I)化合物或如本文中所說明之殺昆蟲組成物於控制害蟲之用途。

【0023】 另一方面係關於如本文中所說明之式(I)化合物於媒介物控制上之用途。

【0024】 還有另一方面係關於種子，其中如本文中所說明之式(I)化合物 業已施用至該種子作為塗層之組份或作為附加層或除塗層外之附加層。

【0025】 因此，另一方面係關於，用於施用包含至少一種如本文中所說明之式(I)化合物的塗層，或用於施用如本文中所說明之式(I)化合物將其施用至種子作為層或除塗層外之附加層之方法，其包括步驟 a) 將種子與包含或包括如本文中所說明之式(I)化合物之包埋物質混合，b) 使所得到之包埋種子組成物豐富，c) 將所得到之富含種子組成物乾燥，d) 將所得到之乾燥種子組成物分離或去凝聚。

【0026】 依取代基之性質而定，本文中所說明之式(I)化合物可任意以幾何及/或光學活性異構體或對應異構體混合物之形式於不同的組成物中。本發明係關於純異構體及關於異構體混合物二者。

【0027】 本發明之化合物亦可為金屬絡合物形式。

定義

【0028】 精於此方面技藝中之人士應瞭解，若未明確地說明，於本申請案中所使用之表述「a」或「an」可，依情況而定，意指「一(1)」、「一(1)或更多」或「至少一個(1)」。

【0029】 精於此方面技藝中之人士應很清楚，於本申請案中所引證之實例不應以限制之方式視之，只不過是詳細說明一些具體例。

【0030】 對於本文中所說明之所有的結構，如環系及基團，其相鄰之原子必須不為-O-O-或-O-S-。

【0031】 為了可更具體地規定，具有可變數目之可能碳原子(C 原子)的結構，於本申請案中係稱為 $C_{\text{碳原子下限}}$-$C_{\text{碳原子上限}}$結構(C_{LL}-C_{UL}結構)。實例：烷基基團可包括 3 至 10 個碳原子且於此情況中係對應於 C_3-C_{10}-烷基。由碳原子及雜原子所組成之環結構可稱為「LL-至 UL-節」結構。6-員環結構之一實例為甲苯(被甲基取代之 6-員環結構)。

【0032】 若總稱於取代基例如(C_{LL}-C_{UL})-烷基時，係於併合取代基，例如(C_{LL}-C_{UL})-環烷基-(C_{LL}-C_{UL})-烷基之末端，則於該併合取代基起點之組份，例如(C_{LL}-C_{UL})-環烷基，可相同或不同且獨立地被後者取代基，例如(C_{LL}-C_{UL})-烷基所單或多取代。使用於本申請案中之所有的總稱，於化學基團、環系及環狀基團時，可經由附加「C_{LL}-C_{UL}」或「LL-至 UL-節」而更具體地規定。

【0033】 除非不同地定義，該總稱之定義於併合取代基中亦適用於此等總稱。實例：C_{LL}-C_{UL}-烷基之定義亦適用於 C_{LL}-C_{UL}-烷基作為併合取代基，例如 C_{LL}-C_{UL}-環烷基-C_{LL}-C_{UL}-烷基之一部分。

【0034】 於上式中給定符號之定義中，所使用之總稱係一般性代表下列之取代基：

【0035】 鹵素係涉及第七主族之元素 ，較佳為氟、氯、溴及碘，更佳為氟、氯及溴，且甚至更佳為氟及氯。

【0036】 雜原子之實例為 N、O、S、P、B、Si。較佳，「雜原子」一詞係關於 N、S 及 O。

【0037】 根據本發明，「烷基」–以其本身或作為化學基團之一部分–

係代表較佳具有 1 至 6 個碳原子之直鏈或分支烴類，例如甲基、乙基、正-丙基、異丙基、正-丁基、異丁基、第二-丁基、第三-丁基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、1,2-二甲基丙基、1,1-二甲基丙基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、己基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,2-二甲基丙基、1,3-二甲基丁基、1,4-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、1,1-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基丁基及 2-乙基丁基。亦佳者為具有 1 至 4 個碳原子之烷基如，尤其是，甲基、乙基、正-丙基、異丙基、正-丁基、異丁基、第二-丁基或第三-丁基。本發明之烷基可被一個或多個相同或不同的原子團所取代。

【0038】 根據本發明，「烯基」–以其本身或作為化學基團之一部分–係代表較佳具有2至6個碳原子及至少一個雙鍵之直鏈或分支烴類，例如乙烯基、2-丙烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-2-戊烯基、4-甲基-2-戊烯基、3-甲基-3-戊烯基、4-甲基-3-戊烯基、1-甲基-4-戊烯基、2-甲基-4-戊烯基、3-甲基-4-戊烯基、4-甲基-4-戊烯基、1,1-二甲基-2-丁烯基、1,1-二甲基-3-丁烯基、1,2-二甲基-2-丁烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-乙基-2-丁烯基、2-乙基-3-丁烯基、1,1,2-三甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯基及 1-乙基-2-甲基-2-丙烯基。亦佳者為具有 2 至 4 個碳原子之烯基如，尤其是，2-丙烯基、2-丁烯基或 1-甲基-2-丙烯基。本發明之烯基可被一個或多個相同或不同的原子團所取代。

【0039】 根據本發明，「炔基」 –以其本身或作為化學基團之一部分–係代表較佳具有2至6個碳原子及至少一種參鍵之直鏈或分支烴類，

例如 2-丙炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、1-甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基、1-乙基-2-丙炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、1-甲基-2-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-3-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、3-甲基-4-戊炔基、4-甲基-2-戊炔基、1,1-二甲基-3-丁炔基、1,2-二甲基-3-丁炔基、2,2-二甲基-3-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-乙基-3-丁炔基、1-乙基-1-甲基-2-丙炔基及 2,5-己二炔基。亦佳者為具有 2 至 4 個碳原子之炔基如，尤其是，乙炔基、2-丙炔基或 2-丁炔基-2-丙烯基。本發明之炔基可被一個或多個相同或不同的原子團所取代。

【0040】 根據本發明，「環烷基」 –以其本身或作為化學基團之一部分–係代表較佳具有 3 至 10 個碳原子之一-、二-或三環之烴類，例如環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基、環辛基、二環[2.2.1]庚基、二環[2.2.2]辛基或金剛烷基。亦佳者為具有 3、4、5、6 或 7 個碳原子之環烷基如，尤其是，環丙基或環丁基。本發明之環烷基可被一個或多個相同或不同的原子團所取代。

【0041】 根據本發明，「烷基環烷基」係代表較佳具有 4 至 10 個或 4 至 7 個碳原子之一-、二-或三環之烷基環烷基，例如甲基環丙基、乙基環丙基、異丙基環丁基、3-甲基環戊基及 4-甲基環己基。亦佳者為具有 4、5 或 7 個碳原子之烷基環烷基如，尤其是，乙基環丙基或 4-甲基環己基。本發明之烷基環烷基可被一個或多個相同或不同的原子團所取代。

【0042】 根據本發明，「環烷基烷基」係代表較佳具有 4 至 10 個或 4 至 7 個碳原子之一-、二-或三環之環烷基烷基，例如環丙基甲基、環丁基甲基、環戊基甲基、環己基甲基及環戊基乙基。亦佳者為具有 4、5 或 7 個碳原子之環烷基烷基如，尤其是，環丙基甲基或環丁基甲基。本發明之環烷基烷基可被一個或多個相同或不同的原子團所取代。

【0043】 根據本發明，「羥基烷基」係代表較佳具有 1 至 6 個碳原子之直鏈或分支的醇，例如甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、第二-丁醇及第三-丁醇。亦佳者為具有 1 至 4 個碳原子之羥基

烷基。本發明之羥基烷基基團可被一個或多個相同或不同的原子團所取代。

【0044】 根據本發明，「烷氧基」係代表較佳具有 1 至 6 個碳原子之直鏈或分支的 O-烷基，例如甲氧基、乙氧基、正-丙氧基、異丙氧基、正-丁氧基、異丁氧基、第二-丁氧基及第三-丁氧基。亦佳者為具有 1 至 4 個碳原子之烷氧基基團。本發明之烷氧基基團可被一個或多個相同或不同的原子團所取代。

【0045】 根據本發明，「烷基硫烷基」係代表較佳具有 1 至 6 個碳原子之直鏈或分支的 S-烷基，例如甲硫基、乙硫基、正-丙硫基、異丙硫基、正-丁硫基、異丁硫基、第二-丁硫基及第三-丁硫基。亦佳者為具有 1 至 4 個碳原子之烷基硫烷基基團。本發明之烷基硫烷基基團可被一個或多個相同或不同的原子團所取代。

【0046】 根據本發明，「烷基亞磺醯」係代表較佳具有 1 至 6 個碳原子之直鏈或分支的烷基亞磺醯，例如甲亞磺醯、乙亞磺醯、正-丙亞磺醯、異丙亞磺醯、正-丁亞磺醯、異丁亞磺醯、第二-丁亞磺醯及第三-丁亞磺醯。亦佳者為具有 1 至 4 個碳原子之烷基亞磺醯團。本發明之烷基亞磺醯基團可被一個或多個相同或不同的原子團所取代。

【0047】 根據本發明，「烷基磺醯」係代表較佳具有 1 至 6 個碳原子之直鏈或分支的烷基磺醯，例如甲磺醯、乙磺醯、正-丙磺醯、異丙磺醯、正-丁磺醯、異丁磺醯、第二-丁磺醯及第三-丁磺醯。亦佳者為具有 1 至 4 個碳原子之烷基磺醯。本發明之烷基磺醯基團可被一個或多個相同或不同的原子團所取代。

【0048】 根據本發明，「烷基羰基」係代表較佳具有 2 至 7 個碳原子之直鏈或分支的烷基-C(=O)，如甲基羰基、乙基羰基、正-丙基羰基、異丙基羰基、第二-丁基羰基及第三-丁基羰基。亦佳者為具有 1 至 4 個碳原子之烷基羰基。本發明之烷基羰基可被一個或多個相同或不同的原子團所取代。

【0049】 根據本發明，「環烷基羰基」係代表於環烷基部分中較佳具有 3 至 10 個碳原子之直鏈或分支的環烷基羰基，例如環丙基羰基、環丁基羰基、環戊基羰基、環己基羰基、環庚基羰基、環辛基羰基、

二環[2.2.1]庚基、二環[2.2.2]辛基羰基及金剛烷基羰基。亦佳者為於環烷基部分中具有 3、5 或 7 個碳原子之環烷基羰基。本發明之環烷基羰基基團可被一個或多個相同或不同的原子團所取代。

【0050】 根據本發明，「烷氧基羰基」 -單獨或作為化學基團之組份-係代表直鏈或分支的烷氧基羰基，較佳於烷氧基部分中具有 1 至 6 個碳原子或具有 1 至 4 個碳原子，例如甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-丙氧基羰基、異丙氧基羰基、第二-丁氧基羰基及第三-丁氧基羰基。本發明之烷氧基羰基基團可被一個或多個相同或不同的原子團所取代。

【0051】 根據本發明，「烷基胺基羰基」係代表於該烷基部分中較佳具有 1 至 6 個碳原子或 1 至 4 個碳原子之直鏈或分支的烷基胺基羰基，例如甲基胺基羰基、乙基胺基羰基、正-丙基胺基羰基、異丙基胺基羰基、第二-丁基胺基羰基及第三-丁基胺基羰基。本發明之烷基胺基羰基基團可被一個或多個相同或不同的原子團所取代。

【0052】 根據本發明，「N,N-二烷基胺基羰基」係代表於該烷基部分中較佳具有 1 至 6 個碳原子或 1 至 4 個碳原子之直鏈或分支的 N,N-二烷基胺基羰基，例如 N,N-二甲基胺基羰基、N,N-二乙基胺基羰基、N,N-二(正-丙基胺基)羰基、N,N-二(異丙基胺基)羰基及 N,N-二-(第二-丁基胺基)羰基。本發明之 N,N-二烷基胺基羰基基團可被一個或多個相同或不同的原子團所取代。

【0053】 根據本發明，「芳基」係代表較佳具有 6 至 14 個，尤其 6 至 10 個環碳原子之一-、二-或多環之芳族系，例如苯基、萘基、蒽基、菲基，較佳為苯基。此外，芳基亦代表多環系如四氫萘基、茚基、氫茚基、芴基、聯苯基，其中，該鍵合位係在芳族系上。本發明之芳基基團可被一個或多個相同或不同的原子團所取代。

【0054】 經取代芳基之實例為芳基烷基，其可於 C_1-C_4-烷基及/或 C_6-C_{14}-芳基部分中同樣被一個或多個相同或不同之原子團所取代。此等芳基烷基之實例包括苄基及 1-苯基乙基。

【0055】 根據本發明，「雜環」、「雜環的環」或「雜環的環系」係代表碳環的環系具有至少一個環，其中至少一種碳原子係被雜原子，較

佳被來自於基團包括 N、O、S、P、B、Si、Se 之雜原子所替代，且其為飽和，不飽和或雜芳族且可為未經取代或經取代，其中鍵合位係在環原子上。除非不同地定義，該雜環含有較佳 3 至 9 個環原子，尤其 3 至 6 個環原子，且一個或多個，較佳 1 至 4 個，尤其 1、2 或 3 個雜原子，較佳來自於包括 N、O，及 S 之基團於該雜環中，雖然沒有二個氧原子應直接相鄰。該雜環通常含有不超過 4 個氮原子及/或不超過 2 個氧原子及/或不超過 2 個硫原子。當該雜環基原子團或該雜環的環任意被取代時，其可被稠合至其他碳環或雜環的環。於任意經取代雜環基之情況中，本發明亦涵括多環系，例如 8-氮雜二環[3.2.1]辛烷基或 1-氮雜二環[2.2.1]庚基。於任意經取代雜環基之情況中，本發明亦涵括螺環系，例如 1-氧雜-5-氮雜螺[2.3]己基。

【0056】 本發明之雜環基基團為，例如，吡啶基、六氫吡咔基、嗎啉基、硫代嗎啉基、二氫吡喃基、四氫吡喃基、二噁烷基、吡咯啉基、吡咯啶基、咪唑啉基、咪唑啶基、噻唑烷基、噁唑烷基、二噁茂烷基、二噁茂基、吡唑烷基、四氫呋喃基、二氫呋喃基、噁坦基、環氧乙烷基、氮雜環丁烷基(azetidinyl)、氮丙啶基、氧雜氮雜環丁烷基(oxazetidinyl)、氧雜氮雜環丙烷基(oxaziridinyl)、噁吖丯基(oxazepanyl)、噁環偶氮喃基(oxazinanly)、噻吖喃基(thiazepanyl)、酮基吡咯啶基、二酮基吡咯啶基、酮基嗎啉基、酮基六氫吡咔基及噁丯基(oxepanyl)。

【0057】 特別重要的是雜芳基，亦即雜芳系。根據本發明，雜芳基一詞係代表雜芳族化合物，亦即完全不飽和之芳族雜環化合物，其涵蓋於上述之雜環定義內。較佳為具有 1 至 3 個，較佳 1 或 2 個來自於上面基團之相同或不同雜原子之 5-至 7-員環。本發明之雜芳基為，例如，呋喃基、噻吩基、吡唑基、咪唑基、1,2,3-及 1,2,4-三唑基、異噁唑基、噻唑基、異噻唑基、1,2,3-、1,3,4-、1,2,4-及 1,2,5-噁二唑基、氮呯基、吡咯基、吡啶基、嗒咔基、嘧啶基、吡咔基、1,3,5-、1,2,4-及 1,2,3-三咔基、1,2,4-、1,3,2-、1,3,6-及 1,2,6-噁咔基、噁呯基(oxepinyl)、噻呯基(thiepinyl)、1,2,4-三唑啉基(triazolonyl)及 1,2,4-二氮呯基。本發明之雜芳基基團亦可被一個或多個相同或不同之原子團所取代。

「(任意)經取代之」基團/取代基，如經取代之烷基、烯基、炔基、烷氧基、烷基硫烷基、烷基亞磺醯、烷基磺醯、環烷基、芳基、苯基、苄基、雜環基及雜芳基一詞意指，例如，由未經取代之基本結構所導生之經取代原子團，其中該取代基，例如，1 個(1)取代基或多數取代基，較佳 1、2、3、4、5、6 或 7 個係選自於基團包括胺基、羥基、鹵素、硝基、氰基，異氰基、巯基、異氰硫基、C_1-C_4-羧基、碳醯胺、SF_5、胺基磺醯、C_1-C_4-烷基、C_3-C_4-環烷基、C_2-C_4-烯基、C_3-C_4-環烯基、C_2-C_4-炔基、N-單-C_1-C_4-烷基胺基、N,N-二-C_1-C_4-烷基胺基、N-C_1-C_4-烷醯胺基、C_1-C_4-烷氧基、C_2-C_4-烯基氧基、C_2-C_4-炔基氧基、C_3-C_4-環烷氧基、C_3-C_4-環烯基氧基、C_1-C_4-烷氧基羰基、C_2-C_4-C_2-C_4-烯基氧基羰基、C_2-C_4-炔基氧基羰基、C_6-,C_{10}-,C_{14}-芳基氧基羰基、C_1-C_4-烷醯基、C_2-C_4-烯基羰基、C_2-C_4-炔基羰基、C_6-,C_{10}-,C_{14}-芳基羰基、C_1-C_4-烷基硫烷基、C_3-C_4-環烷基硫烷基、C_1-C_4-烷基硫基、C_2-C_4-烯基硫基、C_3-C_4-環烯基硫基、C_2-C_4-炔基硫基、C_1-C_4-烷基氧硫基及C_1-C_4-烷基亞磺醯，包括 C_1-C_4-烷基亞磺醯基之兩個對映體、C_1-C_4-烷基磺醯、N-一-C_1-C_4-烷基胺基磺醯、N,N-二-C_1-C_4-烷基胺基磺醯、C_1-C_4-烷基氧膦基、C_1-C_4-烷基膦醯，包括 C_1-C_4-烷基氧膦基與 C_1-C_4-烷基膦醯之兩個對映體、N-C_1-C_4-烷基胺基羰基、N,N-二-C_1-C_4-烷基胺基羰基、N-C_1-C_4-烷醯胺基羰基、N-C_1-C_4-烷醯-N-C_1-C_4-烷基胺基羰基、C_6-,C_{10}-,C_{14}-芳基、C_6-,C_{10}-,C_{14}-芳基氧基、苄基、苄基氧基、苄基硫基、C_6-,C_{10}-,C_{14}-芳基硫基、C_6-,C_{10}-,C_{14}-芳基胺基、苄基胺基、雜環基及三烷基矽烷基，經由雙鍵結合之取代基，如 C_1-C_4-次烷基(例如亞甲基或亞乙基)、酮基基團、亞胺基基團及經取代之亞胺基基團。當二個或多個原子團形成一個或多個環時，此等可為碳環的，雜環的，飽和，部份飽和，不飽和的環，例如包括芳族環且被進一步取代。

【0058】 藉實例提及之取代基(「第一取代基級位」)，若其等含有含烴之組份，可任意於其中，例如被一個或多個取代基各自獨立地選自於鹵素、羥基、胺基、硝基、氰基、異氰基、疊氮基、醯基胺基、酮基基團及亞胺基基團所進一步取代(「第二取代基級位」)。「(任意地)取代之」基團一詞較佳涵括只有一個或二個取代基程度。

【0059】 本發明經鹵素取代之化學基團(例如烷基或烷氧基)係被鹵素多至最大可能數目之取代基所單或多取代。此等基團亦被稱為鹵素基團(例如鹵烷基)。於被鹵素所多取代之情況中，該鹵素原子可為相同或不同，且可全部鍵結到一個碳原子或可結合到多個碳原子。鹵素特別為氟、氯、溴或碘，較佳為氟、氯或溴且更佳為氟。更特別是，經鹵素取代之基團為一鹵代環烷基如 1-氟環丙基、2-氟環丙基或 1-氟環丁基、一鹵代烷基如 2-氯乙基、2-氟乙基、1-氯乙基、1-氟乙基、氯甲基，或氟甲基；全鹵代烷基如三氯甲基或三氟甲基或CF_2CF_3、多鹵烷基如二氟甲基、2-氟-2-氯乙基、二氯甲基、1,1,2,2-四氟乙基或 2,2,2-三氟乙基。鹵烷基之其他實例為三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、氯甲基、溴甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、五氟乙基、3,3,3-三氟丙基及五氟-第三-丁基。較佳者為鹵烷基具有 1 至 4 個碳原子及 1 至 9 個，較佳 1 至 5 個選自於氟、氯及溴之相同或不同的鹵素原子。特別佳者為鹵烷基具有 1 或 2 個碳原子及 1 至 5 個選自於氟及氯之相同或不同的鹵素原子，例如尤其二氟甲基、三氟甲基或 2,2-二氟乙基。鹵素取代化合物之其他實例為鹵烷氧基，如OCF_3、$OCHF_2$、OCH_2F、OCF_2CF_3、OCH_2CF_3、OCH_2CHF_2 及OCH_2CH_2Cl、鹵烷基硫烷基，如二氟甲基硫基、三氟甲基硫基、三氯甲基硫基、氯二氟甲基硫基、1-氟乙基硫基、2-氟乙基硫基、2,2-二氟乙基硫基、1,1,2,2-四氟乙基硫基、2,2,2-三氟乙基硫基或 2-氯-1,1,2-三氟乙基硫基、鹵烷基亞磺醯，如二氟甲基亞磺醯、三氟甲基亞磺醯、三氯甲基亞磺醯、氯二氟甲基亞磺醯、1-氟乙基亞磺醯、2-氟乙基亞磺醯、2,2-二氟乙基亞磺醯、1,1,2,2-四氟乙基亞磺醯、2,2,2-三氟乙基亞磺醯及 2-氯-1,1,2-三氟乙基亞磺醯、鹵烷基亞磺醯，如二氟甲基亞磺醯、三氟甲基亞磺醯、三氯甲基亞磺醯、氯二氟甲基亞磺醯、1-氟乙基亞磺醯、2-氟乙基亞磺醯、2,2-二氟乙基亞磺醯、1,1,2,2-四氟乙基亞磺醯、2,2,2-三氟乙基亞磺醯及 2-氯-1,1,2-三氟乙基亞磺醯、鹵烷基磺醯團，如二氟甲基磺醯、三氟甲基磺醯、三氯甲基磺醯、氯二氟甲基磺醯、1-氟乙基磺醯、2-氟乙基磺醯、2,2-二氟乙基

磺醯、1,1,2,2-四氟乙基磺醯、2,2,2-三氟乙基磺醯及 2-氯-1,1,2-三氟乙基磺醯。

【0060】 於原子團具有碳原子之情況中，較佳為那些具有 1 至 4 個碳原子，尤其 1 或 2 個碳原子者。較佳之取代基通常來自於鹵素之基團，例如氟及氯，(C_1-C_4)-烷基，較佳甲基或乙基、(C_1-C_4)-鹵烷基，較佳三氟甲基，(C_1-C_4)-烷氧基，較佳甲氧基或乙氧基，(C_1-C_4)-鹵烷氧基、硝基及氰基。此處特別佳之取代基為甲基、甲氧基、氟及氯。

【0061】 經取代之胺基，如經單-或二取代之胺基意指原子團來自於取代胺基原子團之基團，其係例如被一個或二個來自於基團：烷基、羥基、胺基、烷氧基、醯基及芳基之相同或不同的原子團所 N-取代；較佳 N-一-及 N,N-二烷基胺基(例如甲基胺基、乙基胺基、N,N-二甲基胺基、N,N-二乙基胺基、N,N-二-正-丙基胺基、N,N-二異丙基胺基或 N,N-二丁基胺基)，N-一-或 N,N-二烷氧基烷基胺基基團(例如 N-甲氧基甲基胺基、N-甲氧基乙基胺基、N,N-二(甲氧基甲基)胺基或 N,N-二(甲氧基乙基)胺基)、N-一-及 N,N-二芳基胺基，如任意經取代之苯胺、醯基胺基、N,N-二醯基胺基、N-烷基-N-芳基胺基、N-烷基-N-醯基胺基以及飽和 N-雜環；此處較佳係烷基原子團具有 1 至 4 個碳原子；此處芳基較佳為苯基或經取代之苯基；於醯基時，所給定之定義進一步適用於下，較佳為(C_1-C_4)-烷醯。同樣適用於經取代之羥基胺基或肼基。

【0062】 根據本發明，「環狀胺基基團」一詞係涵括具有一個或多個氮原子之雜芳族或脂肪族環系。該雜環為飽和或不飽和，包含一個或多個任意稠合的環系且任意含有另外的雜原子，例如，一個或二個氮、氧及/或硫原子。此外，形成環狀胺基基團的原子數目沒有限制且可包括，例如，於 3 至 8 個環原子之一-環系之情況中，且於 7 至 11 個原子之二-環系之情況中。

【0063】 具有飽和及不飽和單環基團具有氮原子作為雜原子之環狀胺基基團的實例包括 1-氮雜環丁烷基(azetidinyl)、吡咯烷基、2-吡咯啶-1-基、1-吡咯基、六氫吡啶基、1,4-二氫吡啡-1-基、1,2,5,6-四氫吡啡-1-基、1,4-二氫吡啶-1-基、1,2,5,6-四氫吡啶-1-基、高六氫吡啶基；具

有飽和及不飽和單環基團具有二個或多個氮原子作為雜原子之環狀胺基基團的實例包括 1-咪唑啶基、1-咪唑基、1-吡唑基、1-三唑基、1-四唑基、1-六氫吡咔基、1-高六氫吡咔基、1,2-二氫六氫吡咔-1-基、1,2-二氫嘧啶-1-基、全氫嘧啶-1-基、1,4-二氮雜環庚-1-基；具有飽和及不飽和單環基團具有 1 個或 2 個氧原子及 1 至 3 個氮原子作為雜原子之環狀胺基基團的實例，例如，噁唑烷-3-基、2,3-二氫異噁唑-2-基、異噁唑-2-基、1,2,3-噁二咔-2-基、嗎啉代。具有飽和及不飽和單環基團具有 1 至 3 個氮原子及 1 至 2 個硫原子作為雜原子之環狀胺基基團的實例包括噻唑烷-3-基、異噻唑啉-2-基、硫代嗎福啉基，或二酮基硫代嗎福啉基；具有飽和及不飽和稠合環基團之環狀胺基基團的實例包括 吲哚-1-基、1,2-二氫苯並咪唑-1-基、全氫吡咯並[1,2-a]吡咔-2-基；具有螺環基團之環狀胺基基團的實例包括 2-氮雜螺[4,5]癸-2-基；具有橋連的雜環基團之環狀胺基基團的實例包括 2-氮雜二環[2.2.1]庚-7-基。

【0064】 經取代之胺基亦包括具有 4 個有機取代基於氮原子上之季銨化合物(鹽類)。

【0065】 任意經取代之苯基，較佳為未經取代或被來自於鹵素、(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_4)-烷氧基-(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_4)-烷氧基-(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-鹵烷基、(C_1-C_4)-鹵烷氧基、(C_1-C_4)-烷基硫烷基、(C_1-C_4)-鹵烷基硫烷基、氰基，異氰基、及硝基，例如鄰-、間-及對-甲苯基、二甲基苯基、2-、3-及 4-氯苯基、2-、3-及 4-氟苯基、2-、3-及 4-三氟甲基-及-三氯甲基苯基、2,4-、3,5-、2,5-及 2,3-二氯苯基、鄰-、間-及對-甲氧基苯基、4-七氟苯基之相同或不同原子團之基團所單-或多取代，較佳多至三取代之苯基。

【0066】 任意經取代之環烷基，較佳為未經取代或被來自於鹵素、氰基，(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_4)-烷氧基-(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_4)-烷氧基-(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-鹵烷基及(C_1-C_4)-鹵烷氧基之相同或不同原子團之基團，尤其被一個或二個(C_1-C_4)-烷基原子團所單-或多取代，較佳多至三取代之環烷基。

【0067】 任意經取代之雜環基，較佳為未經取代或被來自於鹵素、氰

基，(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_4)-烷氧基-(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_4)-烷氧基-(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-鹵烷基、(C_1-C_4)-鹵烷氧基、硝基及酮基之相同或不同原子團之基團所單或多取代，較佳多至三取代，尤其被來自於鹵素，(C_1-C_4)-烷基、(C_1-C_4)-烷氧基、(C_1-C_4)-鹵烷基及酮基之基團所單或多取代，最佳被一個或二個(C_1-C_4)-烷基原子團所取代之雜環基。

【0068】 烷基-取代之雜芳基的實例為呋喃基甲基、噻吩基甲基、吡唑基甲基、咪唑基甲基、1,2,3-及 1,2,4-三唑基甲基、異噁唑基甲基、噻唑基甲基、異噻唑基甲基、1,2,3-、1,3,4-、1,2,4-及 1,2,5-噁二唑基甲基、氮呯基甲基、吡唑基甲基、吡啶基甲基、嗒𠯿基甲基、嘧啶基甲基、吡𠯿基甲基、1,3,5-、1,2,4-及 1,2,3-三𠯿基甲基、1,2,4-、1,3,2-、1,3,6-及 1,2,6-噁𠯿基甲基、噁呯基(oxepinyl)甲基、噻呯基(thiepinyl)甲基及 1,2,4-二氮呯基甲基。

【0069】 本發明之化合物可於較佳之具體例中存在。本文中所說明之各個具體例可彼此組合。不包括者為違反自然定律，且精於此方面技藝中之人士將因此依據他/她的專業知識而予以排除之組合物。例如，具有 3 個或多個相鄰氧原子之環結構係被排除在外。

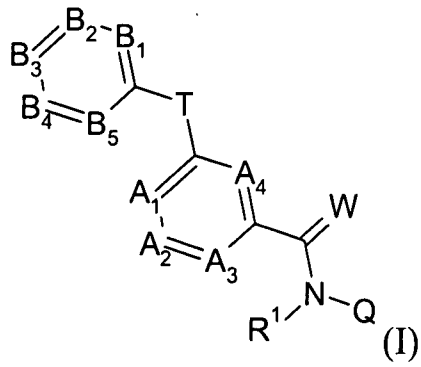
本發明化合物之具體例

【0070】 精於此方面技藝中之人士將顯而易見所有的具體例可單獨或於組合物中存在。

【0071】 式(I)化合物，尤其式(Ia)、(Ib)、(Ic)、(Id)與(Ie)化合物，如果適當，於不同的組成物中可依該取代基之性質而定，可為鹽類、互變異構體、幾何及/或光學活性異構體或對應異構體混合物之形式。

【0072】 如果適當，本發明之化合物可為各種多晶形形式或為不同多晶形形式之混合物的形式。純多晶形物及多晶形物混合物二者形成本發明主題之一部分且可根據本發明使用。

【0073】 式(I)化合物之具體例詳細說明於下：



(I)

其中

R^1 為 H、於每一情況中任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-炔基、C_3-C_7-環烷基、C_1-C_6-烷基羰基、C_1-C_6-烷氧基羰基、芳基(C_1-C_3)-烷基、雜芳基(C_1-C_3)-烷基，

下列之部分係如下：

A_1 為 CR^2 或 N，

A_2 為 CR^3 或 N，

A_3 為 CR^4 或 N，

A_4 為 CR^5 或 N，

B_1 為 CR^6 或 N；

B_2 為 CR^7 或 N，

B_3 為 CR^8 或 N，

B_4 為 CR^9 或 N，且

B_5 為 CR^{10} 或 N，

但 A_1 至 A_4 部分中不超過 3 個為 N 且 B_1 至 B_5 部分中不超過 3 個同時為 N；

R^2、R^3、R^4、R^5、R^6、R^7、R^9 及 R^{10} 各自獨立為 H、鹵素、氰基、硝基、於每一情況中任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_3-C_6-環烷基、C_1-C_6-烷氧基、N-C_1-C_6-烷氧基亞胺基-C_1-C_3-烷基、C_1-C_6-烷基硫烷基、C_1-C_6-烷基亞磺醯、C_1-C_6-烷基磺醯、N-C_1-C_6-烷基胺基或 N,N-二-C_1-C_6-烷基胺基；

如果沒有 A_2 及 A_3 部分為 N，則 R^3 及 R^4 與其等所結合之碳原子一起可形成含有 0、1 或 2 個氮原子及/或 0 或 1 個氧原子及/或 0 或 1 個硫原子之 5-或 6-員環，或

如果沒有 A_1 及 A_2 部分為 N，則 R^2 及 R^3 與其等所結合之碳原子一起可形成含有 0、1 或 2 個氮原子之 6-員環；

R^8 為鹵素、氰基、硝基、於每一情況中任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_3-C_6-環烷基、C_1-C_6-烷氧基、N-C_1-C_6-烷氧基亞胺基-C_1-C_3-烷基、C_1-C_6-烷基硫烷基、C_1-C_6-烷基亞磺醯、C_1-C_6-烷基磺醯、N-C_1-C_6-烷基胺基或 N,N-二-C_1-C_6-烷基胺基；

W 為 O 或 S；

Q 為 H、甲醯基、羥基、胺基或於每一情況中任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-炔基、C_3-C_6-環烷基、C_1-C_5-雜環烷基、C_1-C_4-烷氧基、C_1-C_6-烷基-C_3-C_6-環烷基、C_3-C_6-環烷基-C_1-C_6-烷基、C_6-,C_{10}-C_{14}-芳基、C_1-C_5-雜芳基、C_6-,C_{10}-,C_{14}-芳基-C_1-C_3-烷基、C_1-C_5-雜芳基-C_1-C_3-烷基、N-C_1-C_4-烷基胺基、N-C_1-C_4-烷基羰基胺基，或 N,N-二-C_1-C_4-烷基胺基；或

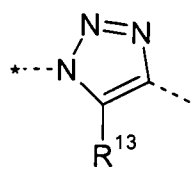
為任意多-V-取代之不飽和 6-員碳環；或

為任意多-V-取代之不飽和 5-或 6-員雜環，其中，

V 獨立為鹵素、氰基、硝基、於每一情況中任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_1-C_4-烯基、C_1-C_4-炔基、C_3-C_6-環烷基、C_1-C_6-烷氧基、N-C_1-C_6-烷氧基亞胺基-C_1-C_3-烷基、C_1-C_6-烷基硫烷基、C_1-C_6-烷基亞磺醯、C_1-C_6-烷基磺醯，或 N,N-二-(C_1-C_6-烷基)胺基；

T 為含有 3 個雜原子，較佳選自於基團包括 N、O 及 S 於每一情況中任意經取代之 5-員雜芳族系，

及式(I)化合物之鹽、N-氧化物及互變異構體形式，



於 T 不為 之條件下，

其中，R^{13} 為 H、鹵素、C_1-C_4-烷基、經鹵素取代之 C_1-C_6-烷基或氰基。

【0074】 於較佳之具體例中，R^1 於式(I)化合物中為 H、於每一情況中任意經取代之甲基、乙基、正-丙基、異丙基、正-丁基、異丁基、第二-丁基、第三-丁基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、丙氧基甲基、甲基羰基、乙基羰基、正-丙基羰基、異丙基羰基、第二-丁基羰基、第三

-丁基羰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正-丙氧基羰基、異丙氧基羰基、第二-丁氧基羰基、第三-丁氧基羰基、氰基甲基、2-氰基乙基、苄基、4-甲氧基苄基、吡啶-2-基甲基、吡啶-3-基甲基、吡啶-4-基甲基、4-氯吡啶-3-基甲基。於甚至更佳之具體例中，R^1 為 H。

【0075】 於進一步較佳之具體例中，W 為 O。

【0076】 於進一步較佳之具體例中，Q 為 H、於每一情況中任意經取代之甲基、乙基、正-丙基、1-甲基乙基、1,1-二甲基乙基、1-甲基丙基、正-丁基、2-甲基丙基、2-甲基丁基、羥基甲基、2-羥基丙基、氰基甲基、2-氰基乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1-三氟甲基乙基、2,2-二氟丙基、3,3,3-三氟丙基、2,2-二甲基-3-氟丙基、環丙基、1-氰基環丙基、1-甲氧基羰基環丙基、1-(N-甲基胺基甲醯)環丙基、1-(N-環丙基胺基甲醯)環丙基、環丙基甲基、環丁基、環戊基、環己基、1-環丙基乙基、雙(環丙基)甲基、2,2-二甲基環丙基甲基、2-苯基環丙基、2,2-二氯環丙基、反式-2-氯環丙基、順式-2-氯環丙基、2,2-二氟環丙基、反式-2-氟環丙基、順式-2-氟環丙基、反式-4-羥基環己基、4-三氟甲基環己基、丙-2-烯基、2-甲基丙-2-烯基、丙-2-炔基、1,1-二甲基丁-2-炔基、3-氯丙-2-烯基、3,3-二氯丙-2-烯基、3,3-二氯-1,1-二甲基丙-2-烯基、苯基、2-氯苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、喔坦-3-基、噻坦-3-基、1-氧撐噻坦-3-基、1,1-二氧撐噻坦-3-基、異喔唑-3-基甲基、2-酮基-2-(2,2,2-三氟乙基胺基)乙基、1,2,4-三唑-3-基甲基、3-甲基喔坦-3-基甲基、苄基、2,6-二氟苯基甲基、3-氟苯基甲基、2-氟苯基甲基、2,5-二氟苯基甲基、1-苯基乙基、4-氯苯基乙基、2-三氟甲基苯基乙基、1-吡啶-2-基乙基、吡啶-2-基甲基、5-氟吡啶-2-基甲基、(6-氯吡啶-3-基)甲基、嘧啶-2-基甲基、甲氧基、2-乙氧基乙基、2-(甲基硫烷基)乙基、1-甲基-2-(乙基硫烷基)乙基、2-甲基-1-(甲基硫烷基)丙-2-基、甲氧基羰基、甲氧基羰基甲基、NH_2、N-乙基胺基、N-烯丙基胺基、N,N-二甲基胺基、N,N-二乙基胺基；或 Q 為下列者之一，其各個被 0-4 個 V 取代基：苯基、萘基、嗒吩、吡吩、嘧啶、三吩、吡啶、吡唑、噻唑、異噻唑、喔唑、異喔唑、三唑、咪唑、呋喃、噻吩、吡咯、喔二唑、噻二唑所取代，其中，

V 獨立為 F、Cl、Br、I、氰基、硝基、甲基、乙基、二氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、氯甲基、溴甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,2,2,2-四氟乙基、1-氯-1,2,2,2-四氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、1,1-二氟乙基、五氟乙基、七氟-正-丙基、七氟異丙基、九氟-正-丁基、環丙基、環丁基、甲氧基、乙氧基、正-丙氧基、1-甲基乙氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、氯二氟甲氧基、二氯氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、五氟乙氧基、N-甲氧基亞胺基甲基、1-(N-甲氧基亞胺基)乙基、甲基硫烷基、甲基磺醯、甲基亞磺醯、三氟甲基磺醯、三氟甲基亞磺醯、三氟甲基硫烷基、N,N-二甲基胺基。

【0077】 於較佳之具體例中，Q 為氟取代之 C_1-C_4-烷基，如 2,2,2-三氟乙基、2,2-二氟乙基、3,3,3-三氟丙基；C_3-C_4-環烷基，如環丙基或環丁基；任意經取代之 C_3-C_4-環烷基，如 1-氰基環丙基、反式-2-氟環丙基，或順式-2-氟環丙基；C_4-C_6-雜環烷基，如噁坦-3-基、噻坦-3-基、1-氧撐噻坦-3-基或 1,1-二氧撐噻坦-3-基；苄基；吡啶-2-基甲基；甲基磺醯；或 2-酮基-2-(2,2,2-三氟乙基胺基)乙基。

【0078】 於特別佳之具體例中，Q 為氟取代之 C_1-C_3-烷基，如 2,2,2-三氟乙基或 3,3,3-三氟丙基；環丙基；任意經取代之環丙基，如 1-氰基環丙基或 1-三氟甲基環丙基、噻坦-3-基；或 2-酮基-2-(2,2,2-三氟乙基)胺基乙基。

【0079】 於較佳之具體例中，A_1 至 A_4 部分中不超過一個(1)為 N (換句話說：A_1 至 A_4 (較佳 A_2)中一個(1)為 N)；或 A_1 至 A_4 中無(0)為 N (換句話說：A_1 至 A_4 各自為 CR^2、CR^3、CR^4，及 CR^5)。

【0080】 於進一步較佳之具體例中，R^2、R^3、R^4 及 R^5 (若對應之 A 部分為 CR)於式(I)化合物中各自獨立為 H、鹵素、氰基、硝基、於每一情況中任意經取代之 C_1-C_4-烷基、C_3-C_4-環烷基、C_1-C_4-烷氧基、N-C_1-C_4-烷氧基亞胺基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷基硫烷基、C_1-C_4-烷基亞磺醯、C_1-C_4-烷基磺醯、N-C_1-C_4-烷基胺基，或 N,N-二-C_1-C_4-烷基胺基。

【0081】 於進一步較佳之具體例中，R^2及R^5各自獨立為H、甲基、F及Cl。

【0082】 於進一步較佳之具體例中，R^3及R^4各自獨立為H、F、Cl、Br、I、氰基、硝基、甲基、乙基、氟甲基、二氟甲基、氯二氟甲基、三氟甲基、2,2,2-三氟乙基、甲氧基、乙氧基、正-丙氧基、1-甲基乙氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、氯二氟甲氧基、二氯氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、五氟乙氧基、N-甲氧基亞胺基甲基、1-(N-甲氧基亞胺基)乙基、甲基硫烷基、三氟甲基硫烷基、甲基磺醯、甲基亞磺醯、三氟甲基磺醯、三氟甲基亞磺醯。

【0083】 於較佳之具體例中，B_1至B_5部分中不超過一個(1)為N (換句話說：一個(1) B_1至B_5為N)；或無(0) B_1至B_5為N (換句話說：B_1至B_5各自為CR^6、CR^7、CR^8、CR^9及CR^{10})。

【0084】 於進一步較佳之具體例中，R^6、R^7、R^9及R^{10} (當對應之B部分為CR時)各自獨立為H、鹵素、氰基、硝基、於每一情況中任意經取代之C_1-C_4-烷基、C_3-C_4-環烷基、C_1-C_4-烷氧基、N-烷氧基亞胺基烷基、C_1-C_4-烷基硫烷基、C_1-C_4-烷基亞磺醯、C_1-C_4-烷基磺醯、N-C_1-C_4-烷基胺基、N,N-二-C_1-C_4-烷基胺基。

【0085】 於進一步較佳之具體例中，R^6、R^7、R^9及R^{10}各自獨立為H、鹵素、氰基、硝基、甲基、乙基、氟甲基、二氟甲基、氯二氟甲基、三氟甲基、2,2,2-三氟乙基、甲氧基、乙氧基、正-丙氧基、1-甲基乙氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、氯二氟甲氧基、二氯氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、五氟乙氧基、N-甲氧基亞胺基甲基、1-(N-甲氧基亞胺基)乙基、甲基硫烷基、三氟甲基硫烷基、甲基磺醯、甲基亞磺醯、三氟甲基磺醯、三氟甲基亞磺醯。

【0086】 於進一步較佳之具體例中，R^6及R^{10}各自獨立為H、鹵素、氰基、硝基、甲基、乙基、二氟甲基、氯二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、1-甲基乙氧基、二氟甲氧基、氯二氟甲氧基、二氯氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、甲

基硫烷基、三氟甲基硫烷基、甲基磺醯、甲基亞磺醯、三氟甲基磺醯、三氟甲基亞磺醯。

【0087】 於進一步較佳之具體例中，R^6及R^{10}為本文所說明之取代基，但R^6及R^{10}於一化合物中不同時為H。換句話說，當R^6於化合物中為H時，R^{10}為本文中所說明之其他取代基之一，且反之亦然。

【0088】 於進一步較佳之具體例中，R^6及R^{10}各自為選自於鹵素(如Cl或F)、C_1-C_3-烷基、鹵代C_1-C_3-烷基、C_1-C_3-烷氧基及鹵代C_1-C_3-烷氧基之取代基。

【0089】 於進一步較佳之具體例中，R^6及R^{10}各自為鹵素(如Cl或F)，各自為C_1-C_3-烷基，或各自為鹵代C_1-C_3-烷基，例如全氟代C_1-C_3-烷基(例如全氟丙基)。

R8

【0090】 於進一步較佳之具體例中，R^8於式(I)化合物中為鹵素、氰基、硝基、經鹵素取代之C_1-C_4-烷基、C_3-C_4-環烷基、C_1-C_4-烷氧基、N-C_1-C_4-烷氧基亞胺基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷基硫烷基、C_1-C_4-烷基亞磺醯、C_1-C_4-烷基磺醯、N-C_1-C_4-烷基胺基或N,N-二-C_1-C_4-烷基胺基。

【0091】 於進一步較佳之具體例中，R^8為鹵素或經鹵素取代之C_1-C_4-烷基如氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、甲基、乙基、二氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、氯甲基、溴甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,2,2,2-四氟乙基、1-氯-1,2,2,2-四氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、1,1-二氟乙基、五氟乙基、五氟-第三-丁基、七氟-正-丙基、七氟異丙基、九氟-正-丁基、九氟-第二-丁基、環丙基、環丁基、甲氧基、乙氧基、正-丙氧基、1-甲基乙氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、氯二氟甲氧基、二氯氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、五氟乙氧基、N-甲氧基亞胺基甲基、1-(N-甲氧基亞胺基)乙基、甲基硫烷基、甲基磺醯、甲基亞磺醯、三氟甲基磺醯、三氟甲基亞磺醯、三氟甲基硫烷基、N,N-二甲基胺基。

【0092】 於更佳之具體例中，R^8 為二氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,2,2,2-四氟乙基、1-氯-1,2,2,2-四氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、1,1-二氟乙基、五氟乙基、五氟-第三-丁基、七氟-正-丙基、七氟異丙基、九氟-正-丁基、九氟-第二-丁基、氟甲氧基、二氟甲氧基、氯二氟甲氧基、二氯氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、五氟乙氧基、三氟甲基磺醯、三氟甲基亞磺醯、三氟甲基硫烷基。

【0093】 於特別佳之具體例中，R^8 為全氟代 C_1-C_3-烷基如全氟代之正-或異-丙基($-C_3F_7$)、全氟代乙基(C_2F_5)或全氟代甲基(CF_3)，更佳係全氟代之正-或異-丙基($-C_3F_7$)或全氟代甲基。

【0094】 於進一步較佳之具體例中，A_1 至 A_4 及 B_1 至 B_5 部分於式(I)化合物中係如下：

A_1 為 C-H，

A_2 為 CR^3 或 N，

A_3 為 CR^4，

A_4 為 CR^5 或 N，

B_1 為 CR^6 或 N，

B_2 為 CR^7，

B_3 為 CR^8，

B_4 為 CR^9 且

B_5 為 CR^{10} 或 N。

【0095】 於甚至更佳之具體例中，A_1 至 A_4 及 B_1 至 B_5 部分於式(I)化合物中係如下：

A_1 為 C-H，

A_2 為 CR^3 或 N，

A_3 為 CR^4，

A_4 為 C-H，

B_1 為 CR^6 或 N，

B_2 為 C-H，

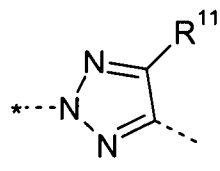
B_3 為 CR^8，

B_4 為 C-H 且

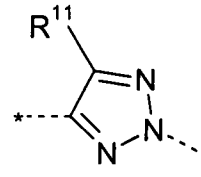
B_5 為 CR^{10} 或 N。

T

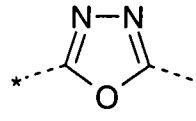
【0096】 於進一步較佳之具體例中，T 為展示於下之一種 5-員雜芳族系，其中，連結到(C-B_1-B_5)環系之碳原子的鍵係以標記有星號之虛線鍵，且連結到(C-A_1-A_2-A_3-C-A_4)-環系之碳原子的鍵係以虛線來識別



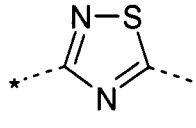
T6



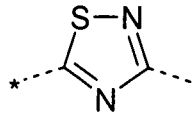
T7



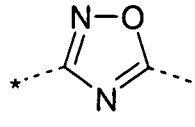
T17



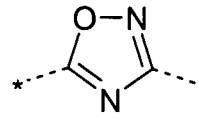
T36



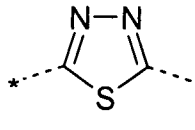
T37



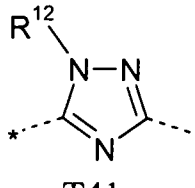
T38



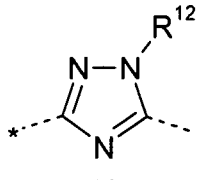
T39



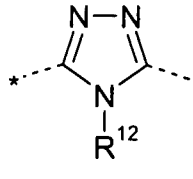
T40



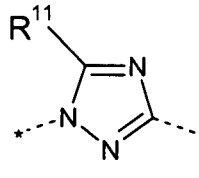
T41



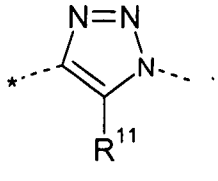
T42



T43



T44



T48

其中，

R^{11} 獨立為 H、鹵素、氰基、硝基、胺基或於每一情況中任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷基氧基、C_1-C_6-烷基羰基、C_1-C_6-烷基硫

烷基、C_1-C_6-烷基亞磺醯、C_1-C_6-烷基磺醯，較佳為 H；且

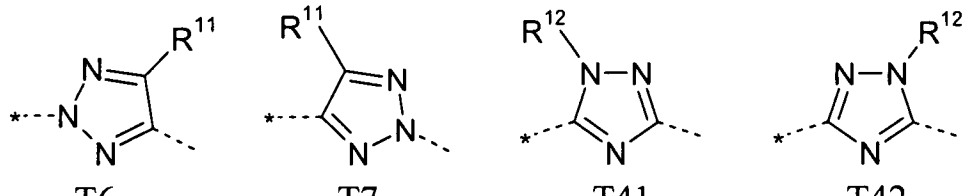
n 具有 0 或 1 之值；且

R^{12} 為 H、鹵素、氰基、硝基、胺基或任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷基氧基、C_1-C_6-烷基羰基、C_1-C_6-烷基硫烷基、C_1-C_6-烷基亞磺醯、C_1-C_6-烷基磺醯，較佳 H 或甲基。

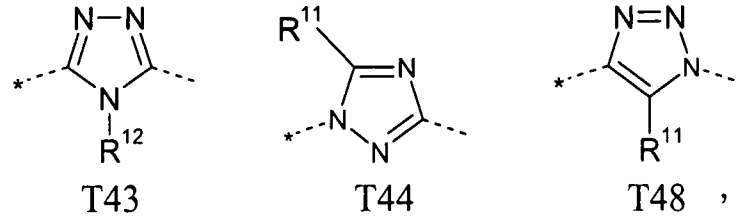
【0097】 於進一步較佳之具體例中，R^{11} 為 H、鹵素、氰基、硝基、胺基、甲基、乙基、1-甲基乙基、第三-丁基、三氟甲基、二氟甲基、甲氧基、乙氧基、三氟甲氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、甲基羰基、乙基羰基、三氟甲基羰基、甲基硫烷基、甲基亞磺醯、甲基磺醯、三氟甲基磺醯、三氟甲基硫烷基或三氟甲基亞磺醯。

【0098】 於更佳之具體例中，R^{11} 為 H、甲基、乙基、2-甲基乙基、2,2-二甲基乙基、氟、氯、溴、碘、硝基、三氟甲基或胺基。

【0099】 於進一步較佳之具體例中，T 為顯示於下之一種 5-員雜芳族系，其中，連結到(C-B_1-B_5)環系之碳原子的鍵係以標記有星號之虛線鍵，且連結到(C-A_1-A_2-A_3-C-A_4)-環系之碳原子的鍵係以虛線來識別



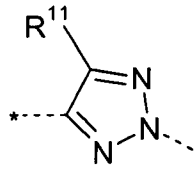
T6 T7 T41 T42



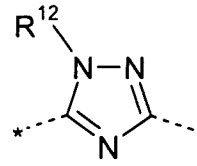
T43 T44 T48 ，

其中，R^{11} 及 R^{12} 各自定義如本文中所說明者。

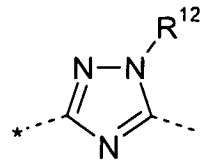
【0100】 於特別較佳之具體例中，T 為顯示於下之一種 5-員雜芳族系，其中，連結到(C-B_1-B_5)環系之碳原子的鍵係以標記有星號之虛線鍵，且連結到(C-A_1-A_2-A_3-C-A_4)-環系之碳原子的鍵係以虛線來識別



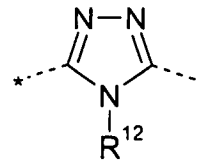
T7



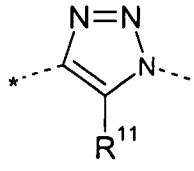
T41



T42



T43



T48，

其中，R^{11} 及 R^{12} 係各自定義如本文中所說明者。

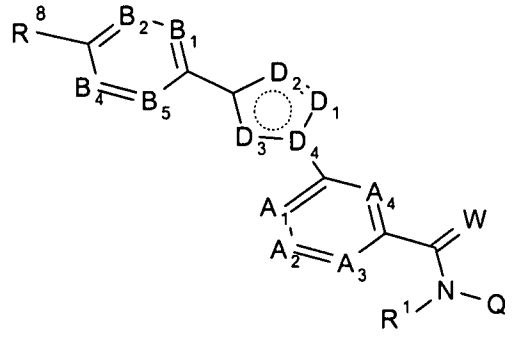
【0101】 於進一步特別佳之具體例中，T 為顯示於下之一種 5-員雜芳族系，其中，連結到(C-B_1-B_5)環系之碳原子的鍵係以標記有星號之虛線鍵，且連結到(C-A_1-A_2-A_3-C-A_4)-環系之碳原子的鍵係以虛線來識別



T48，

其中，R^{11} 係定義如本文中所定義者。

【0102】 進一步較佳之具體例係另外關於式(Ia)化合物



(Ia)

其中

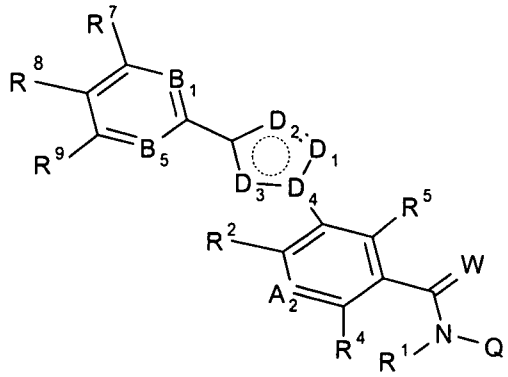
R^1、R^{11}、Q、W、A_1、A_2、A_3、A_4、B_1、B_2、B_3、B_4 及 B_5 係各自定義如本文中所說明者，其中，選自於 A_1、A_2、A_3、A_4 中不超過 1 個部分為 N 且選自於 B_1、B_2、B_3、B_4 及 B_5 中不超過 1 個部分為 N；且 D_1、D_2 及 D_3 各自獨立為 C-R^{11} 或雜原子，較佳 C-R^{11} 或雜原子係選自於 N、O 及 S；且

D_4 為 C 或選自於 N 之雜原子；

其中選自於 D_1、D_2、D_3 及 D_4 之 3 個部分為雜原子；且

◌ 為芳族系。

【0103】 進一步較佳之具體例係另外關於式(Ib)化合物



(Ib)

其中

R^1、R^2、R^4、R^5、R^7、R^8、R^9、R^{11}、Q、W、A_2、B_1 及 B_5 係各自定義如本文中所說明者；

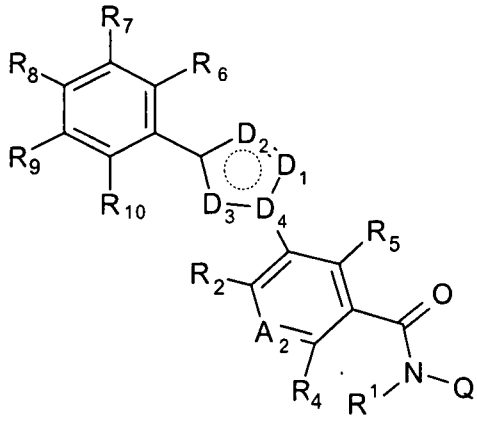
D_1、D_2 及 D_3 各自獨立為 C-R^{11} 或雜原子，較佳 C-R^{11} 或雜原子係選自於 N、O 及 S；且

D_4 為 C 或選自於 N 之雜原子；

其中選自於 D_1、D_2、D_3 及 D_4 之 3 個部分為雜原子；且

◌ 為芳族系

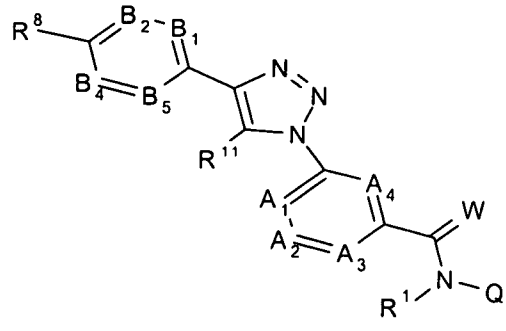
【0104】 進一步較佳之具體例係關於式(Ic)化合物



(Ic)

其中，R^1、R^2、R^4、R^5、R^6、R^7、R^8、R^9、R^{10}、R^{11}、A_2、Q、D_1、D_2、D_3 及 ◌ 係各自定義如本文中所說明者。

【0105】 進一步較佳之具體例係關於式(Id)化合物

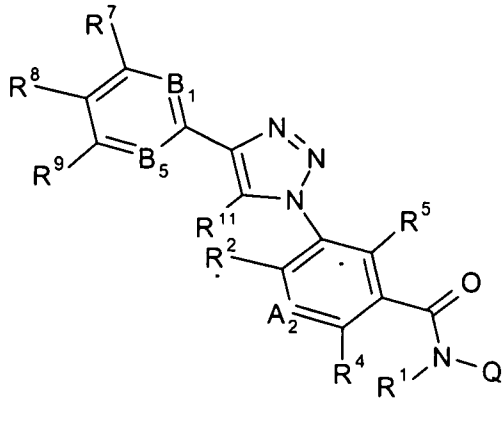


(Id)

其中，R^1、R^8、R^{11}、Q、W、A_1、A_2、A_3、A_4、B_1、B_2、B_3、B_4 及 B_5 係各自定義如本文中所說明者，

其中選自於 A_1、A_2、A_3、A_4 中不超過 1 個部分為 N 且選自於 B_1、B_2、B_3、B_4 及 B_5 中不超過 1 個部分為 N。

【0106】 進一步較佳之具體例中係關於式(Ie)化合物



(Ie)

其中，R^1、R^2、R^4、R^5、R^7、R^8、R^9、R^{11}、Q、A_2、B_1 及 B_5 係各自定義如本文中所說明者。

【0107】 特別佳之具體例係關於式(I)化合物、(Ia)、(Ib)、(Ic)、(Id)或(Ie)，其中 R^8 為 C_1-C_6-烷基、鹵代 C_1-C_6-烷基、C_3-C_6-環烷基、鹵代 C_3-C_6-環烷基、C_1-C_6-烷氧基、鹵代 C_1-C_6-烷氧基、N-烷氧基亞胺基烷基、鹵代 C_1-C_6-烷基硫烷基、鹵代 C_1-C_6-烷基亞磺醯、鹵代 C_1-C_6-烷基磺醯、N-C_1-C_6-烷基胺基、N,N-二-C_1-C_4-烷基胺基，且為氟、氯、溴、碘、氰基或硝基。實例為氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、甲基、乙基、二氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、氯甲基、溴甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,2,2,2-四氟乙基、1-氯-1,2,2,2-四氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、1,1-二氟乙基、五氟乙基、五氟-第三-丁基、七氟-正-丙基、七氟異丙基、九氟-正-丁基、九氟-第二-丁基、環丙基、環丁

基、甲氧基、乙氧基、正-丙氧基、1-甲基乙氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、氯二氟甲氧基、二氯氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、五氟乙氧基、N-甲氧基亞胺基甲基、1-(N-甲氧基亞胺基)乙基、甲基硫烷基、甲基磺醯、甲基亞磺醯、三氟甲基磺醯、三氟甲基亞磺醯、三氟甲基硫烷基、N,N-二甲基胺基。更佳，R^8 為鹵代 C_1-C_4-烷基，如二氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,2,2,2-四氟乙基、1-氯-1,2,2,2-四氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、1,1-二氟乙基、五氟乙基、五氟-第三-丁基、七氟-正-丙基、七氟異丙基、九氟-正-丁基、九氟-第二-丁基；鹵代 C_1-C_4-烷氧基，如氟甲氧基、二氟甲氧基、氯二氟甲氧基、二氯氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、五氟乙氧基；三氟甲基磺醯；三氟甲基亞磺醯；或三氟甲基硫烷基。甚至更佳，R^8 為二氟甲基、三氯甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,2,2,2-四氟乙基、1-氯-1,2,2,2-四氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、1,1-二氟乙基、五氟乙基、五氟-第三-丁基、七氟-正-丙基、七氟異丙基、九氟-正-丁基、九氟-第二-丁基、氟甲氧基、二氟甲氧基、氯二氟甲氧基、二氯氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、五氟乙氧基、三氟甲基磺醯、三氟甲基亞磺醯或三氟甲基硫烷基。

【0108】 更佳，R^8 於式(Ib)化合物中為全氟代 C_1-C_3-烷基，如全氟代丙基($-C_3F_7$)、全氟代乙基(C_2F_5)或全氟代甲基(CF_3)，最佳為全氟代丙基($-C_3F_7$)或全氟代甲基。

【0109】 適用於根據本發明之本發明化合物的鹽類，例如，鹼或酸加成鹽，為所有習用無毒性的鹽類，較佳為農業及/或生理上可接受的鹽。較佳為與無機鹼的鹽，例如鹼金屬鹽(例如鈉、鉀或銫鹽)、鹼土金屬鹽(例如鈣或鎂鹽)、銨鹽或與機鹼的鹽，特別為與有機胺，例如三乙基銨、二環己基銨、N,N'-二苄基伸乙基二銨、鈚錠、甲基鈚錠(picolinium)或乙醇銨鹽、與無機酸之鹽(例如氫氯化物、氫溴化物、

二氫硫酸鹽、三氫硫酸鹽或磷酸鹽)、與有機羧酸或有機磺酸的鹽(例如甲酸鹽、醋酸鹽、三氟醋酸鹽、順式丁烯二酸鹽、酒石酸鹽、甲烷磺酸酯、苯磺酸酯或4-甲苯磺酸酯)。眾所周知第三胺，例如一些本發明之化合物能夠形成N-氧化物者同樣是本發明的鹽。

【0110】 於不同的組成物中，依取代基之性質而定，式(I)化合物可為幾何及/或光學活性異構體或對應異構體混合物之形式。此等立體異構體為，例如，對映體、非對映體、阻轉異構體或幾何異構體。因此，本發明係涵括純立體異構體及此等異構體之混合物二者。

【0111】 本發明亦關於用於控制動物害蟲之方法，其中式(I)化合物係允許於動物害蟲及/或其等之棲息地上作用。動物害蟲之控制較佳於農業及林業中，及於物料保護中進行。較佳係不包括用於外科手術或治療性處理人類或動物之方法，及於人類或動物體上進行之診斷方法。

【0112】 本發明進一步關於式(I)化合物作為農藥，特別是作物保護劑之用途。

【0113】 於本申請案之內文中，「農藥」一詞亦總是包含「作物保護劑」一詞。

【0114】 式(I)化合物其給予良好的植物耐受性、有利的溫血動物毒性及良好的環境相容性，係適用於保護植物及植物器官對抗生物及非生物壓迫因子，用於提高收成產量，用於改善收穫物料之品質及用於控制動物害蟲，特別於農業中、於園藝中、於動物畜牧中、於水產養殖中，於森林中、於花園及休閒設施中、於儲存產物及物料之保護中，及於衛生領域中所遇到之昆蟲、蜘蛛、蠕蟲、線蟲及軟體動物。彼等較佳可用作為農藥。彼等係有效對抗一般敏感性及抗藥性物種且對抗全部或某些發展階段。上述害蟲包括：

【0115】 來自於節肢動物門，尤其來自於蛛形目之害蟲，例如粉蟎，例如粗腳粉蟎、枸杞瘤節蜱、桔芽癭蟎、刺皮節蜱、刺銹蟎，例如福克刺銹蟎(Aculus fokeui)、蘋果刺銹蟎、花蜱、橫紋葉蟎、隱喙蜱、方頭蜱、短須蟎，例如紫紅短須蟎、麥苔蟎(Bryobia graminum)、苜蓿苔蟎、刺蠍、足蟎、雞皮刺蟎、歐洲室塵蟎、粉塵蟎、革蜱、始

葉蟎，例如希克利始葉蟎(Eotetranychus hicoriae)、梨上癭蟎、葉蟎，例如班氏真葉蟎(Eutetranychus banksi)、癭蟎，例如梨葉癭蟎、家食甜蟎、赤足夜蟎、茶黃蟎，例如茶半跗線蟎(=側多食跗線蟎)、璃眼蜱、硬蜱、紅斑蛛、褐蛛、秋收恙蟎、棕隱士蛛(Nuphersa spp.)、小爪蟎，例如康氏小爪蟎(Oligonychus coniferarum)、伊利小爪蟎(Oligonychus ilicis)、印度小爪蟎(Oligonychus indicus)、檬果小爪蟎、草地小爪蟎、石榴小爪蟎、約氏小爪蟎(Oligonychus yothersi)、鈍緣蜱、禽刺蟎、全爪蟎，例如桔全爪蟎(=Metatetranychus citri)、蘋果全爪蟎(=Metatetranychus ulmi)、柑橘銹蟎、皂角葉蟎(Platytetranychus multidigituli)、側多食跗線蟎、癢蟎、扇頭蜱、根蟎、蚧蟎、中東金蠍、狹跗線蟎、稻細蟎(Steneotarsonemus spinki)、茶黃蟎，例如亂跗線蟎、蒼白跗線蟎(Tarsonemus pallidus)、葉蟎，例如加拿大葉蟎、赤葉蟎、土耳其斯坦葉蟎、二點葉蟎、阿氏恙蟎(Trombicula alfreddugesi)、蟎(Vaejovis spp.)、斜背瘤癭蟎；

來自於唇足綱，例如地蜈蚣(Geophilus spp.)、蚰蜒；

來自於彈尾目或綱，例如刺棘跳蟲(Onychiurus armatus)；綠圓跳蟲(Sminthurus viridis)；

來自於倍足綱，例如斑點節足蟲(Blaniulus guttulatus)；

來自於昆蟲綱，例如來自於蜚蠊目，例如東方蜚蠊、亞洲蜚蠊、德國小蠊、馬得拉蜚蠊、古巴蠊、木蠊(Parcoblatta spp.)、大蠊，例如美洲大蠊、澳洲大蠊、棕帶蟑螂(Supella longipalpa)；

來自於鞘翅目，例如條紋瓜葉甲(Acalymma vittatum)、菜豆象、喙麗金龜、檯木葉甲、細胸叩甲(Agriotes spp.)，例如細胸叩頭蟲(Agriotes linneatus)、小麥金針蟲(Agriotes mancu、小粉蟲(Alphitobius diaperinus)、馬鈴薯雙絡鰓金龜(Amphimallon solstitialis)、家俱竊蠹、天牛、花象，例如棉鈴象甲、圓皮蠹、長喙小象、甘蔗金龜、淺帶羽蛛，例如甜菜隱食甲、黑皮蠹、紅腿巴里斯蟲(Baris caerulescens)、被覆豆象、豆象，例如豌豆象、蚕豆象、龜金花蟲(Cassida spp.)、豆葉甲、金龜(Ceutorrhynchus spp.)，例如白菜籽龜象、四齒龜象(Ceutorrhynchus quadridens)、白粉龜象(Ceutorrhynchus rapae)、凹脛跳甲，例如龍荔

凹脛跳甲(Chaetocnema confinis)、多齒凹脛跳甲(Chaetocnema denticulate)、模凹脛跳甲(Chaetocnema ectypa)、曼地象甲(Cleonus mendicus)、金針蟲、象甲，例如香蕉象甲、褐紐西蘭肋翅鰓角金龜、磕頭蟲(Ctenicera spp.)、象蟲，例如卡麗亞象蟲(Curculio caryae)、卡亞象蟲(Curculio caryatrypes)、歐氏象蟲(Curculio obtusus)、小霞象蟲(Curculio sayi)、銹赤扁谷盜、長角扁谷盜、楊幹象、芒果隱喙象(Cryptorhynchus mangiferae)、細枝象、密點細枝象、洋松細枝象、皮蠹、葉甲，例如黑點葉甲(Diabrotica balteata)、細稈葉甲(Diabrotica barberi)、葉甲(Diabrotica undecimpunctata howardi)、黃瓜十一星葉甲(Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata)、玉米根葉甲(Diabrotica virgifera virgifera)、玉米須葉甲(Diabrotica virgifera zeae)、蛀野螟、稻鐵甲蟲(Dicladispa armigera)、兜蟲(Diloboderus spp.)、食植瓢蟲，例如北方食植瓢蟲(Epilachna borealis)、墨西哥豆瓢蟲、毛跳甲，例如蠕毛跳甲(Epitrix cucumeris)、雙點毛跳甲(Epitrix fuscula)、賀氏毛跳甲(Epitrix hirtipennis)、西方毛跳甲(Epitrix subcrinita)、毛跳甲(Epitrix tuberis)、象甲(Faustinus spp.)、麥裸蛛甲、闊角谷盜、菜心螟(Hellula undalis)、黑異爪蔗金龜、甲蟲(Heteronyx spp.)、優佳金龜(Hylamorpha elegans)、北美家天牛、苜蓿象甲、藍綠象、咪小蠹，例如咖啡果小蠹、隱咪小蠹(Hypothenemus obscurus)、毛咪小蠹(Hypothenemus pubescens)、棕色金龜(Lachnosterna consanguinea)、煙草甲、長頭穀盜、薪甲、合瓜負泥蟲(Lema spp.)、馬鈴薯甲蟲(Leptinotarsa decemlineata)、銀潛蛾，例如咖啡銀潛蛾、稻根象、筒喙象、黃胸葉甲、葉甲(Luperodes spp.)、粉蠹、美洲葉甲(Megascelis spp.)、梳爪叩頭蟲，例如黃色梳爪叩頭蟲(Melanotus longulus oregonensis)、油葉花露尾甲、鰓角金龜，例如歐洲鰓角金龜、天牛(Migdolus spp.)、墨天牛、廣腹細蜂(Naupactus xanthographus)、赤足郭公蟲、金黃蛛甲、椰子犀角金龜、鋸胸谷盜、谷盜(Oryzaphagus oryzae)、象甲(Otiorhynchus spp.)，例如克氏象甲(Otiorhynchus cribricollis)、里氏象甲(Otiorhynchus ligustici)、卵形象甲(Otiorhynchus ovatus)、魯氏象甲(Otiorhynchus rugosostriarus)、黃斑象甲(Otiorhynchus sulcatus)、小青花金龜、辣根

猿葉甲、鰓角金龜、劍鰓角金龜(Phyllophaga helleri)、條跳甲，例如阿氏條跳甲(Phyllotreta armoraciae)、小條跳甲(Phyllotreta pusilla)、多枝條跳甲(Phyllotreta ramose)、黃曲條跳甲、日本弧麗金龜、小象甲、大穀蠹、蚤跳甲，例如近緣蚤跳甲(Psylliodes affinis)、油菜金頭跳甲、凹點蚤跳甲(Psylliodes punctulata)、蛛甲(Ptinus spp.)、黑根瓢蟲(Rhizobius ventralis)、穀蠹、穀象，例如穀象(Sitophilus granarius)、線形象鼻(Sitophilus linearis)、米象、玉米象、穀莖象、藥材甲(Stegobium paniceum)、象甲(Sternechus spp.)，例如象甲(Sternechus paludatus)、象蟲(Symphyletes spp.)、纖毛象，例如玉米象鼻蟲(Tanymecus dilaticollis)、紫檀纖毛象(Tanymecus indicus)、灰褐纖毛象(Tanymecus palliates)、黃粉甲、大谷盜(Tenebrioides mauretanicus)、擬谷盜，例如條紋擬谷盜(Tribolium audax)、赤擬穀盜、染擬谷盜(Tribolium confusum)、班皮蠹、籽象、虎天牛、距步甲，例如黑甲距步甲(Zabrus tenebrioides)；

來自於雙翅目，例如伊蚊屬，例如埃及伊蚊、白紋伊蚊、斯蒂伊紋(aedes sticticus)、刺擾伊蚊、潛蠅，例如苜蓿斑潛蠅、美洲黍潛蠅(Agromyza parvicornis)、按實蠅、按蚊，例如四點按蚊(aedes quadrimaculatus)、岡比亞按蚊(aedes gambiae)、瘿蚊(Asphondylia spp.)、寡毛實蠅，例如瓜實蠅、桔小實蠅、橄欖實蠅、艮毛蚋、紅頭琉璃蠅、紅頭麗蠅、地中海實蠅、搖蚊、金蠅、斑虻、雨生麻虻(Chrysozona pluvialis)、錐蠅、瘿蚊，例如葡萄瘿蚊、甘藍瘿蚊、梨瘿蚊、向日葵瘿蚊、高粱瘿蚊、麥黃吸漿蟲、皮蛆蠅瘤蠅、林間環足搖蚊(Cricotopus sylvestris)、庫蚊，例如尖音庫蚊、五帶淡色庫蚊、庫蠓、脈毛蚊、疽蠅、油欖實蠅、葉瘿蚊，例如油菜葉瘿蚊、花蠅(Delia spp.)，例如蔥蠅(Delia antique)、大米花蠅(Delia coarctata)、弗里花蠅(Delia florilega)、歐洲花蠅(Delia platura)、甘藍地種蠅(Delia radicum)、人膚皮蠅(Dermatobia hominis)、果蠅，例如黑腹果蠅(Drosphila melanogaster)、櫻桃果蠅(Drosophila suzukii)、象甲(Echinocnemus spp.)、廁蠅、胃蠅、舌蠅、麻虻、毛眼水蠅、麥葉毛眼水蠅、種蠅、蝨蠅、皮蠅、斑潛蠅，例如甘藍斑潛蠅、南美斑潛蠅、美洲斑潛蠅、綠蠅，例如銅綠蠅、羅蛉、

S

曼蚊、家蠅，例如家蠅、紅頭麗蠅、鼻蠅、瑞典麥稈蠅、搖蚊(Paratanytarsus spp.)、蠅(Paralauterborniella subcincta)、泉蠅，例如甜菜泉蠅、天仙子泉蠅(Pegomya hyoscyami)、玫瑰泉蠅、白蛉、草種蠅、伏蠅、酪蠅、癭蚋(Prodiplosis spp.)、薔薇莖潛蠅、繞實蠅，例如櫻桃繞實蠅、核桃繞實蠅、黑櫻桃實蠅、歐洲甜櫻桃繞實蠅、實蠅(Rhagoletis mendax)、蘋果實蠅(Rhagoletis pomonella)、大麻蠅、墨蚊，例如南方蚋、螯蠅、牛虻、直斑蠅、大蚊，例如歐洲大蚊、牧場大蚊；

來自於異翅亞目，例如南瓜緣蝽、小赤蝽(Antestiopsis spp.)、蝽(Boisea spp.)、土長蝽(Blissus spp.)、長蝽象(Calocoris spp.)、利韋達盲蝽(Campylomma livida)、異背長蝽(Cavelerius spp.)、臭蟲，例如臭蟲(Cimex adjunctus)、熱帶臭蟲、温帶臭蟲、輻臭蟲、盲蝽(Collaria spp.)、綠盲蝽(Creontiades dilutus)、椒緣蝽(Dasynus piperis)、福脫蝽(Dichelops furcatus)、海威網蝽(Diconocoris hewetti)、棉紅蝽、褐蝽(Euschistus spp.)，例如海洛褐蝽(Euschistus heros)、塞弗褐蝽(Euschistus servus)、川丁褐蝽(Euschistus tristigmus)、瓦里褐蝽(Euschistus variolarius)、扁盾蝽、茶翅蝽、菸葉蛾(Heliopeltis spp.)、諾比蝽(Horcias nobilellus)、緣蝽象、稻緣蝽象、西方花喙緣蝽(Leptoglossus occidentalis)、葉足喙緣蝽(Leptoglossus phyllopus)、麗盲蝽，例如帕布麗盲蝽(Lygocoris pabulinus)、草盲蝽，例如艾里草盲蝽(Lygus elisus)、金星草盲蝽、美國牧草盲蝽、蒜漂長蝽、金光綠盲蝽、绿蝽.，例如稻绿蝽、盾蝽(Oebalus spp.)、甜菜擬網蝽(Piesma quadrata)、璧蝽，例如吉爾璧蝽(Piezodorus guildinii)、雜盲蝽、波斯小爪蟎(Pseudacysta persea)、紅獵蝽、可可褐盲蝽、土蝽(Scaptocoris castanea)、黑蝽象(Scotinophora spp.)、梨冠網蝽、堤巴卡蟲(Tibraca spp.)、錐蝽；

來自於同翅目，例如木蝨(Acizzia acaciaebaileyanae)、木蝨(Acizzia dodonaeae)、木蝨(Acizzia uncatoides)、長頭蝗、無網長管蚜(Acyrthosipon spp.)，例如豌豆蚜、葉蟬(Acrogonia spp.)、稻褐飛虱(Aeneolamia spp.)、木蝨(Agonoscena spp.)、歐洲甘藍粉蝨、甘蔗穴粉蝨、綿粉蝨、馬來木蝨(Allocaridara malayensis)、芒果葉蟬，例如畢

古芒果葉蟬(Amrasca bigutulla)、第瓦芒果葉蟬(Amrasca devastans)、薊圓尾蚜(Anuraphis cardui)、圓蚧，例如紅圓蚧、黃圓蚧、赤圓蚧、梨瘤蚜、蚜蟲，例如黑豆蚜、蚕豆蚜、白頸蚜(Aphis forbesi)、大豆蚜、棉蚜、海德蚜(Aphis hederae)、伊利蚜(Aphis illinoisensis)、米第蚜(Aphis middletoni)、鼠李馬鈴薯蚜(Aphis nasturtii Kaltenbach)、夾竹桃蚜、蘋果蚜、綉線菊蚜、維布尼蚜(Aphis viburniphila)、葡萄阿小葉蟬、木蝨(Arytainilla spp.)、圓蚧、圓盾蚧，例如常春藤圓盾蚧、安塔尼蚧(Atanus spp.)、馬鈴薯長鬚蚜、菸草粉蝨、西方花木蝨(Blastopsylla occidentalis)、茶樹木蝨(Boreioglycaspis melaleucae)、李短尾蚜、微管蚜、甘藍蚜、喀木蝨，例如梨木蝨、馬吉飛蝨(Calligypona marginata)、麗黃頭大葉蟬、甘蔗棉蚜、沫蟬科、蜡蚧、草莓中瘤釘毛蚜(Chaetosiphon fragaefolii)、鹿黃雪盾蚧、黑小綠葉蟬、台灣大蝗、胡桃黑斑蚜、褐圓蚧、翅角頂葉蟬(Cicadulina mbila)、矢盾介殼蟲(Coccomytilus halli)、軟蚧，例如褐軟蠟蚧、長堅介殼蟲、軟蚧(Coccus pseudomagnoliarum)、綠蠟蚧、茶薦隱瘤額蚜(Cryptomyzus ribis)、木蝨(Cryptoneossa spp.)、木蝨(Ctenarytaina spp.)、葉蟬、柑桔粉蝨、柑桔木蝨、白盾蚧、草履碩蚧、西圓尾蚜，例如阿皮西圓尾蚜(Dysaphis apiifolia)、車前圓尾蚜、百合西圓尾蚜、灰粉蚧、小綠葉蟬，例如猛小綠葉蟬(Empoasca abrupta)、馬鈴薯小綠葉蟬、蘋果小綠葉蟬、索蘭諾小綠葉蟬(Empoasca Solana)、史提夫小綠葉蟬(Empoasca stevensi)、綿蚜，例如美洲綿蚜(Eriosoma americanum)、蘋果綿蚜、比里綿蚜(Eriosoma pyricola)、葡萄斑葉蟬、木蝨(Eucalyptolyma spp.)、褐木蝨、二葉殃葉蟬、弗氏粉蚧、咖啡荒粉蚧、紅樹膠木蝨(Glycaspis spp.)、銀合歡木蝨、多刺木蝨(Heteropsylla spinulosa)、翅葉蟬、桃大尾蚜、桃粉蚜、吹綿蚧，例如吹棉蚧(Icerya purchase)、褐浮塵子(Idiocerus spp.)、扁喙葉蟬、介體灰飛虱(Laodelphax striatellus)、蜡蚧(Lecanium spp.)，例如李蜡蚧(Lecanium corni) (=水木堅蚧(Parthenolecanium corni))、榆蠣盾蚧(Lepidosaphes spp.)，例如中榆蠣盾蚧(Lepidosaphes ulmi)、偽菜蚜、長管蚜，例如大戟長管蚜、百合長管蚜(Macrosiphum lilii)、薔薇長管蚜(Macrosiphum rosae)、紫菀點葉蟬、泡沫蟲

(Mahanarva spp.)、高粱蚜、邁卡角蟬(Metcalfiella spp.)、薔薇麥蚜(Metopolophium dirhodum)、前緣平翅斑蚜(Monellia costalis)、胡桃蚜(Monelliopsis pecanis)、瘤額蚜，例如冬蔥瘤額蚜(Myzus ascalonicus)、櫻桃黑斑瘤額蚜(Myzus cerasi)、里古瘤額蚜(Myzus ligustri)、歐納瘤額蚜(Myzus ornatus)、桃蚜、煙瘤額蚜(Myzus nicotianae)、萵苣蚜(Nasonovia ribisnigri)、黑尾葉蟬，例如稻黑尾葉蟬(Nephotettix cincticeps)、二條斑黑尾葉蟬(Nephotettix nigropictus)、褐飛蝨、葉蟬(Oncometopia spp.)、帚狀旌蚧(Orthezia praelonga)、中華稻蝗(Oxya chinensis)、木蝨(Pachypsylla spp.)、楊梅粉蝨、木蝨(Paratrioza spp.)，例如可克木蝨(Paratrioza cockerelli)、片盾蚧、癭綿蚜(Pemphigus spp.)，例如囊柄癭綿蚜(Pemphigus bursarius)、波普癭綿蚜(Pemphigus populivenae)、玉米花翅飛蝨、綿粉蚧，例如美地綿粉蚧(Phenacoccus madeirensis)、常蚜(Phloeomyzus passerinii)、蛇麻疣額蚜(Phorodon humuli)、根瘤蚜，例如第瓦根瘤蚜(Phylloxera devastatrix)、警根瘤蚜、並盾蚧、臀紋粉蚧，例如桔臀紋粉蚧(Planococcus citri)、黃木蝨(Prosopidopsylla flava)、厚緣原綿蚧(Protopulvinaria pyriformis)、桑擬輪盾蚧(Pseudaulacaspis pentagona)、尾粉蚧，例如嗜桔尾粉蚧(Pseudococcus calceolariae)、康氏尾粉蚧(Pseudococcus comstocki)、長尾粉蚧、真葡萄尾粉蚧(Pseudococcus maritimus)、威普尾粉蚧(Pseudococcus viburni)、木蝨(Psyllopsis spp.)、木蝨(Psylla spp.)，例如布西木蝨(Psylla buxi)、蘋果木蝨(Psylla mali)、梨木蝨(Psylla pyri)、金小蜂(Pteromalus spp.)、璐蠟蟬(Pyrilla spp.)、齒盾蚧，例如核桃齒盾蚧(Quadraspidiotus juglansregiae)、歐斯齒盾蚧(Quadraspidiotus ostreaeformis)、梨齒盾蚧、巨蟬(Quesada gigas)、平刺粉蚧、縊管蚜，例如玉米縊管蚜、歐西縊管蚜(Rhopalosiphum oxyacanthae)、禾谷縊管蚜(Rhopalosiphum padi)、路非縊管蚜(Rhopalosiphum rufiabdominale)、黑盔蚧，例如咖啡黑盔蚧(Saissetia coffeae)、米氏黑盔蚧(Saissetia Miranda)、尼氏黑盔蚧(Saissetia neglecta)、橄欖黑盔蚧、葡萄帶葉蟬(Scaphoideus titanus)、麥二叉蚜(Schizaphis graminum)、小花輝盾蚧(Selenaspidus articulatus)、麥長管蚜(Sitobion avenae)、飛蝨

(Sogata spp.)、白背飛蝨、飛蝨(Sogatodes spp.)、菲惕那沫蟬(Stictocephala festina)、灰色粉蝨(Siphoninus phillyreae)、馬來亞飛蟲(Tenalaphara malayensis)、木蝨(Tetragonocephela spp.)、核桃黑蚜(Tinocallis caryaefoliae)、廣胸沫蜂(Tomaspis spp.)、二叉蚜，例如茶二叉蚜(Toxoptera aurantii)、桔二叉蚜、温室白粉蝨、尖翅木虱(Trioza spp.)，例如迪歐尖翅木虱(Trioza diospyri)、小葉蟬(Typhlocyba spp.)、矢尖蚧、葡萄根瘤蚜、斑葉蟬(Zygina spp.)；

來自於膜翅目，例如，切葉蟻(Acromyrmex spp.)、葉蜂(Athalia spp.)，例如蕪菁葉蜂(Athalia rosae)、阿塔蟻(Atta spp.)、鋸角葉蜂(Diprion spp.)，例如，類歐松葉蜂(Diprion similis)、實葉蜂，例如櫻實葉蜂、特氏實葉蜂(Hoplocampa testudinea)、毛蟻、法老蟻(Monomorium pharaonis)、樹蜂(Sirex spp.)、紅火蟻(Solenopsis invicta)、香家蟻(Tapinoma spp.)、樹蜂(Urocerus spp.)、胡蜂，例如黃邊胡蜂(Vespa crabro)、塞里斯蜂(Xeris spp.)；

來自於等足目，例如，平常平甲蟲(Armadillidium vulgare)、二櫛水潮蟲(Oniscus asellus)、鼠婦；

來自於等翅目，例如，乳白蟻，例如台灣家白蟻、庫目蟻(Cornitermes cumulans)、堆沙白蟻(Cryptotermes spp.)、楹白蟻(Incisitermes spp.)、大白蟻(Microtermes obesi)、土白蟻(Odontotermes spp.)、散白蟻，例如黃枝散白蟻、金星散白蟻(Reticulitermes Hesperus)；

來自於鱗翅目，例如小蠟螟(Achroia grisella)、桑劍紋夜蛾、褐帶捲蛾(Adoxophyes spp.)，例如，棉褐帶卷蛾、白斑煩夜蛾(Aedia leucomelas)、夜蛾(Agrotis spp.)，例如蕪菁夜蛾(Agrotis segetum)、球菜夜蛾(Agrotis ipsilon、阿拉巴馬蛾(Alabama spp.)，例如，木棉蟲(Alabama argillacea)、螟蛾(Amyelois transitella)、條麥蛾、斜紋夜蛾(Anticarsia spp.)，例如大豆夜蛾(Anticarsia gemmatalis)、黃螟、甘藍夜盜蛾、秈挵蝶(Borbo cinnara)、棉潛蛾(Bucculatrix thurberiella)、松尺蠖、木夜蛾(Busseola spp.)、捲葉蛾(Cacoecia spp.)、茶細蛾、網葉蛾(Capua reticulana)、姬葉捲蛾、桃柱果蠹蛾、冬唇口蟲(Cheimatobia brumata)、稻草螟，例如皮雷稻草螟(Chilo plejadellus)、二化螟蛾、

S

色捲蛾、葡萄果蠹蛾(Clysia ambiguella)、稻縱捲螟(Cnaphalocerus spp.)、稻縱捲葉野螟蛾(Cnaphalocrocis medinalis)、云捲蛾、細蛾(Conopomorpha spp.)、球頸象、木夜蛾(Copitarsia spp.)、小捲蛾(Cydia spp.)，例如，豌豆小卷蛾(Cydia nigricana)、蘋果蠹蛾、類飛蛾(Dalaca noctuides)、網野螟、小蔗稈草螟(Diatraea saccharalis)、瘤蛾(Earias spp.)、捲蛾(Ecdytolopha aurantium)、南美玉米苗斑螟、甘薯稈螟、粉斑螟(Ephestia spp.)，例如烟草粉斑螟(Ephestia elutella)、地中海粉斑螟(Ephestia kuehniella)、油松小捲蛾、蘋淡褐捲蛾、莢斑螟、掠捲蛾、女貞細捲蛾、黃毒蛾，例如黃毒蛾(Euproctis chrysorrhoea)、切夜蛾(Euxoa spp.)、臟切葉蛾、大蠟螟(Galleria mellonella)、細蛾、小食心蟲，例如梨小食心蟲、普尼小食心蟲(Grapholita prunivora)、螟蛾、夜蛾，例如棉鈴蟲蛾(Helicoverpa armigera)、谷實夜蛾、實夜蛾，例如菸草夜蛾、擬衣蛾(Hofmannophila pseudospretella)、同斑螟、長捲蛾、櫻桃巢蛾(Hyponomeuta padella)、柿蒂蛾、貪夜蛾、茄黃斑螟、銀潛蛾，例如咖啡潛夜蛾、潛葉細蛾，例如布蘭卡潛夜細蛾(Lithocolletis blancardella)、綠果蛾(Lithophane antennata)、花翅小蛾，例如種葡萄捲葉蛾、豆切根蟲(Loxagrotis albicosta)、毒蛾，例如舞毒蛾、潛蛾，例如桃潛葉蛾(Lyonetia clerkella)、天幕毛蟲、豆莢野螟、甘藍夜蛾、暮眼蝶(Melanitis leda)、毛脛夜蛾、蕈蛾(Monopis obviella)、東方粘蟲(Mythimna separata)、木栓蛾(Nemapogon cloacellus)、水螟、避債蛾(Oiketicus spp.)、利亞蛾(Oria spp.)、螟蛾(Orthaga spp.)、玉米螟(Ostrinia spp.)，例如歐洲玉米螟(Ostrinia nubilali)、黑角負泥蟲(Oulema melanopu)、稻負泥蟲、冬夜蛾、稻弄蝶、麥蛾(Pectinophora spp.)，例如棉紅鈴蟲(Pectinophora gossypiella)、潛夜蛾、茄麥蛾，例如馬鈴薯麥蛾(Phthorimaea operculella)、柑橘潛夜蛾、小潛細蛾，例如潛葉蟲(Phyllonorycter blancardella)、小潛細蛾(Phyllonorycter crataegella)、菜粉蝶，例如紋白蝶、捲葉蛾(Platynota stultana)、印度谷螟(Plodia interpunctella)、金翅夜蛾、小菜蛾(Plutella xylostella) (=菱紋背蛾)、巢蛾(Prays spp.)、斜紋夜蛾、天蛾(Protoparce spp.)、黏夜蛾(Pseudaletia spp.)，例如一星黏蟲(Pseudaletia unipuncta)、大豆尺夜

蛾、歐洲玉米螟、木夜蛾(Rachiplusia nu)、三化螟(Schoenobius spp.)，例如畢氏白禾螟(Schoenobius bipunctifer)、白禾螟(Scirpophaga spp.)，例如螟蛾(Scirpophaga innotata)、蕪菁夜蛾(Scotia segetum)、水稻大螟，例如蛀莖夜蛾(Sesamia inferens)、長須捲蛾、斜紋夜蛾，例如南方灰翅夜蛾(Spodoptera eradiana)、甜菜夜蛾、草地夜蛾、巴氏灰翅夜蛾(Spodoptera praefica)、展足蛾(Stathmopoda spp.)、花生麥蛾(Stomopteryx subsecivella)、透翅蛾(Synanthedon spp.)、翅型麥蛾(Tecia solanivora)、木夜蛾(Thermesia gemmatalis)、毛毯穀蛾(Tinea cloacella)、袋谷蛾(Tinea pellionella)、幕谷蛾(Tineola bisselliella)、捲葉蛾、毛毯衣蛾(Trichophaga tapetzella)、粉紋夜蛾，例如粉紋夜蛾(Trichoplusia ni)、三化螟(Tryporyza incertulas)、蕃茄夜蛾、小灰蝶(Virachola spp.)；

來自於直翅目或跳躍亞目，例如家蟋蟀、蚱蜢(Dichroplus spp.)、螻蛄，例如歐洲螻蛄(Gryllotalpa gryllotalpa)、蔗蝗、飛蝗，例如亞洲飛蝗、黑蝗，例如破壞黑蝗(Melanoplus devastator)、沙漠蝗；

來自於蝨毛目，例如，牛蝨、血蝨、長顎蝨、人蝨、葡萄根蚜蟲、恥陰蝨、毛蝨；

來自於嚙蟲目，例如家嚙蟲(Lepinotus spp.)、嗜蟲書蝨(Liposcelis spp.)；

來自於蚤目，例如，角葉蚤、櫛首蚤，例如狗櫛首蚤、貓櫛首蚤、致癢蚤、穿皮潛蚤、印度客蚤；

來自於纓翅目，例如玉米黃呆薊馬、有稻薊馬、蔓薊馬(Drepanothrips reuteri)、花生薊馬(Enneothrips flavens)、花薊馬，例如煙草薊馬(Frankliniella fusca)、西方花薊馬、舒滋花薊馬(Frankliniella schultzei)、小麥花薊馬(Frankliniella tritici)、瓦西花薊馬(Frankliniella vaccinii)、威廉期花薊馬(Frankliniella williamsi)、陽針薊馬、溫室條薊馬、麗色皺針薊馬(Rhipiphorothrips cruentatus)、硬薊馬、帶薊馬(Taeniothrips cardamomi)、薊馬，例如棕櫚薊馬、蔥薊馬；

來自於衣魚目(=總尾目)，例如毛衣魚(Ctenolepisma spp.)、西洋衣魚、盜火蟲(Lepismodes inquilinus)、家衣魚(Thermobia domestica)；

來自於綜合綱，例如么蚰，例如無點家蚰蜒(Scutigerella immaculata)；

【0116】 來自於軟體動物門，例如來自於雙殼綱(Bivalvia)之害蟲，例如殼葉蛤(Dreissena spp.)，

以及來自於腹足綱，例如蛞蝓(Arion spp.)，例如魯弗斯黑蛞蝓（Arion ater rufus）、扁捲螺、水泡螺、蛞蝓(Deroceras spp.)，例如光滑野蛞蝓(Deroceras laeve)、土蝸、椎實螺、釘螺、黃金螺、琥珀螺；

【0117】 來自於扁形動物門及線蟲綱之動物寄生蟲類，例如鉤口線蟲，例如十二指腸鉤蟲、錫蘭鉤蟲、巴西鉤蟲(Acylostoma braziliensis)、蛔蟲、馬來絲蟲、帝汶絲蟲、仰口線蟲、夏氏線蟲(Chabertia spp.)、枝睪吸蟲、古柏線蟲、雙腔吸蟲、絲狀網尾線蟲(Dictyocaulus filaria)、廣節裂頭絛蟲、麥地那龍線蟲、細粒棘球絛蟲、多房型棘球絛蟲、蠕形住腸蟯蟲、肝片吸蟲、血矛線蟲、異刺線蟲、短膜殼絛蟲、豬圓線蟲(Hyostrongulus spp.)、羅阿絲蟲(Loa Loa)、細頸線蟲、食道口線蟲、後睪吸蟲、盤尾絲蟲、奧斯特線蟲、並殖吸蟲、血吸蟲(Schistosomen spp.)、福氏類圓線蟲(Strongyloides fuelleborni)、糞類圓線蟲、類圓線蟲(Stronyloides spp.)、牛鉤絛蟲、有鉤絛蟲、旋毛形線蟲、鄉土毛形線蟲、布氏毛形線蟲(Trichinella britovi)、納氏毛形線蟲(Trichinella nelsoni)、假旋毛形線蟲(Trichinella pseudopsiralis)、毛圓線蟲、鞭形鞭蟲(Trichuris trichuria)、班氏吳策線蟲(Wuchereria bancrofti)；

【0118】 來自於線蟲綱，亦即植物寄生性線蟲之植物害蟲，尤其野外墊刃線蟲(Aglenchus spp.)，例如居農野外墊刃線蟲(Aglenchus agricola)、癭線蟲，例如小麥腫癭線蟲、葉芽線蟲(Aphelenchoides spp.)，例如花生滑刃線蟲(Aphelenchoides arachidis)、草莓滑刃線蟲、芹刺線蟲(Belonolaimus spp.)，例如刺線蟲(Belonolaimus gracilis)、長尾刺線蟲(Belonolaimus longicaudatus)、諾氏刺線蟲(Belonolaimus nortoni)、松材線蟲，例如椰子傘滑刃線蟲 (Bursaphelenchus cocophilu)、尹氏傘滑刃線蟲(Bursaphelenchus eremu)、嗜木質松材線蟲(Bursaphelenchus xylophilus)、線蟲(Cacopaurus spp.)，例如鼠線蟲(Cacopaurus pestis)、根結線蟲(Criconemella spp.)，例如彎曲小環線蟲(Criconemella curvata)、歐諾小環線蟲(Criconemella onoensis)、中環

線蟲(Criconemella ornate)、路辛小環線蟲(Criconemella rusium)、盤間小環線蟲(Criconemella xenoplax) (=盤間中環線蟲(Mesocriconema xenoplax))、輪線蟲，例如芬奈輪線蟲(Criconemoides ferniae)、歐諾輪線蟲(Criconemoides onoense)、歐納輪線蟲(Criconemoides ornatum)、莖線蟲(Ditylenchus spp.)，例如鱗球莖莖線蟲、錐線蟲(Dolichodorus spp.)、胞囊線蟲(Globodera spp.)，例如馬鈴薯胞囊線蟲、馬鈴薯金線蟲、螺旋線蟲，例如雙子宮螺旋線蟲(Helicotylenchus dihystera)、體環線蟲(Hemicriconemoides spp.)、鞘線蟲(Hemicycliophora spp.)、孢囊線蟲(Heterodera spp.)，例如禾穀孢囊線蟲(Heterodera avenae)、大豆孢囊線蟲、甜菜孢囊線蟲(Heterodera schachtii)、紐帶線蟲、長針線蟲(Longidorus spp.)，例如非洲長針線蟲(Longidorus africanus)、根結線蟲(Meloidogyne spp.)，例如奇特伍德根結線蟲(Meloidogyne chitwoodi)、假芋根結線蟲(Meloidogyne fallax)、北方根結線蟲、南方根結線蟲、黑瘤線蟲(Meloinema spp.)、根瘤線蟲(Nacobbus spp.)、擬莖線蟲(Neotylenchus spp.)、擬滑刃線蟲(Paraphelenchus spp.)、擬毛刺線蟲(Paratrichodorus spp.)，例如小擬毛刺線蟲(Paratrichodorus minor)、短體線蟲(Pratylenchus spp.)，例如穿刺短體線蟲(Pratylenchus penetrans)、線蟲(Pseudohalenchus spp.)、平滑墊刃線蟲(Psilenchus spp.)、線蟲(Punctodera spp.)、線蟲(Quinisulcius spp.)、穿孔線蟲(Radopholus spp.)，例如柑橘穿孔線蟲 Radopholus citrophilus)、黑刺穿孔線蟲(Radopholus similis)、腎形線蟲(Rotylenchulus spp.)、盤旋線蟲(Rotylenchus spp.)、盾線蟲(Scutellonema spp.)、根瘤內線蟲(Subanguina spp.)、毛刺線蟲(Trichodorus spp.)，例如鈍毛刺線蟲(Trichodorus obtusu)、原始毛刺線蟲(Trichodorus primitivus)、矮化線蟲(Tylenchorhynchus spp.)，例如飾環矮化線蟲(Tylenchorhynchus annulatu)、小墊刃線蟲(Tylenchulus spp.)，例如半穿小墊刃線蟲(Tylenchulus semipenetrans)、劍線蟲(Xiphinema spp.)，例如指標劍線蟲(Xiphinema index)。

【0119】 此外，其可用於控制原生動物門，球蟲目，例如，艾美球蟲(Eimeria spp.)。

【0120】 該式(I)化合物任意以特定之濃度或施用率亦可用作為除莠劑、安全劑、生長調節劑或改善植物特性之試劑，作為殺微生物劑或殺配子劑，例如作為殺真菌劑、抗黴菌劑、殺細菌劑、殺病毒劑(包括抗類病毒藥劑)或作為抗 MLO 藥劑(像黴漿菌屬生物)及 RLO(像立克次氏體屬生物)。如果適當，其等亦可於其他活性組成份之合成時用作為中間體或先質。

【0121】 本發明進一步關於包含至少一種式(I)化合物之配製物及由其等所製備之使用形式作為農藥，例如浸漬液、滴液及噴灑液。於某些情況中，該使用形式係包括另外的農藥及/或改善作用之佐劑，如滲透劑，例如植物油，例如油菜籽油、葵花子油、礦物油，例如石蠟油、植物脂肪酸之烷基酯，例如油菜籽油甲基酯或大豆油甲基酯，或烷醇烷氧化物及/或擴展劑，例如烷基矽氧烷及/或鹽類，例如有機或無機銨或鏻鹽，例如硫酸銨或磷酸氫二銨及/或保留促進劑，例如磺基琥珀酸二辛酯或羥基丙基樹膠酯聚合物及/或濕潤劑，例如甘油及/或肥料，例如含銨、鉀或磷之肥料。

【0122】 習用配製物為，例如水溶性液體(SL)、乳化濃縮物(EC)、水乳劑(EW)、懸式濃縮物(SC、SE、F、OD)、水分散性粒劑(WG)、粒劑(GR)及膠囊濃縮物(CS)；此等及其他可能之配製物類型係，例如，由國際作物生命及於 FAO 之發展及使用手冊上之農藥規格中，及 WHO 於農藥之規範，FAO 植物生產與保護文件-173 中說明，其係由 FAO/WHO 於 2004，ISBN：9251048576 農藥規格聯合會議製備。該配製物，除了一個或多個式(I)化合物，可任意包含其他農化活性組成份。

【0123】 此等較佳包含助劑，例如增充劑、溶劑、自發性促進劑、載體、乳化劑、分散劑、霜凍保護劑、殺菌劑、增稠劑及/或其他助劑，例如佐劑之配製物或使用形式。於本內文中，佐劑為提高該配製物之生物效應，而無需該組份本身具有生物效應之組份。佐劑之實例為促進保留、擴散、附著於葉表面或滲透之試劑。

【0124】 此等配製物係以已知方式，例如藉由式(I)化合物與助劑，例如增充劑、溶劑及/或固態載體及/或其他助劑，例如表面活化劑混合

而製造。該配製物係於適當設備中或者於施用前或施用過程中製備。

【0125】 所使用之助劑可為適合賦予至式(I)化合物之配製物，或此等配製物所製備之使用形式(例如立即可用之農藥，如噴灑液或種子敷料產品)特殊性質，如特定物理、技術及/或生物特性之物質。

【0126】 適當之增充劑為，例如，水、極性與非極性有機化學液體，例如來自於芳族與非芳族烴類(如石蠟、烷基苯、烷基萘、氯苯)，醇類與多元醇(其亦可任意被取代、醚化及/或酯化)，酮類(如丙酮、環己酮)，酯類(包括脂肪與油)及(聚)醚，未經取代與經取代之胺、醯胺、內醯胺(如 N-烷基吡咯烷酮)及內酯，碸與亞碸(如二甲亞碸)。

【0127】 若所使用之增充劑為水，其亦可使用，例如，有機溶劑作為輔助溶劑。有用的液態溶劑主要為：芳族化合物如二甲苯、甲苯或烷基萘、氯化芳族化合物及氯化脂族烴類如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷，脂族烴類如環己烷或石蠟，例如石油餾份、礦物油及植物油，醇類如丁醇或乙二醇及其等之醚及酯，酮類如丙酮，甲基乙基酮，甲基異丁基酮或環己酮，強極性溶劑如二甲基甲醯胺及二甲亞碸，以及水。

【0128】 原則上，可使用所有的適當溶劑。適當溶劑之實例為芳香烴類，如二甲苯、甲苯或烷基萘，氯化芳族或脂族烴如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷，脂族烴類如環己烷、石蠟、石油餾分、礦物油及植物油，醇類如甲醇、乙醇、異丙醇、丁醇或乙二醇及其等之醚與酯類，酮類如丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁基酮或環己酮，強極性溶劑，如二甲亞碸，及水。

【0129】 原則上，可使用所有的適當載體。有用的載體尤其包括：例如，銨鹽與研碎之天然礦物如高嶺土、黏土、滑石、白堊、石英、打白石、蒙脫土或矽藻土，及研碎之合成礦物，如細碎之矽石、礬土及天然或合成之矽酸鹽、樹脂、蠟及/或固態肥料。此等載體之混合物同樣可以使用。有用於顆粒之載體包括：例如，壓碎與分級之天然礦石如方解石、大理石、浮石、海泡石、白雲石，及無機與有機穀粉之合成顆粒，以及有機物料如木屑、紙、椰子殼、玉蜀黍穗

軸及煙草稈之顆粒。

【0130】 亦可使用液化氣體增充劑或溶劑。特別合適之增充劑或載體為那些於標準溫度及於標準壓力下為氣態者，例如，氣溶膠推進劑氣體，如鹵化烴類，以及丁烷、丙烷、氮及二氧化碳。

【0131】 乳化劑及/或泡沫形成劑、分散劑或潤濕劑具有離子或非離子性者，或此等表面活化劑之混合物之實例為，聚丙烯酸之鹽類、木質磺酸的鹽類、苯酚磺酸或萘磺酸之鹽類、乙烯化氧與脂肪醇或與脂肪酸或與脂肪族胺，與經取代苯酚(較佳為烷基酚或芳基酚)之縮聚物，磺基琥珀酸酯之鹽類、牛磺酸衍生物(較佳為烷基牛磺酸酯)，聚乙氧基化醇或苯酚之磷酸酯，多元醇之脂肪酸酯，及含硫酸酯、磺酸酯及磷酸酯化合物之衍生物，例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸酯、烷基硫酸酯、芳基磺酸酯、蛋白質水解產物、木質素亞硫酸鹽廢液，及甲基纖維素。若一種式(I)化合物及/或一種惰性載體不溶於水，且當施用係於水中進行時，存有表面活性物質係有利的。

【0132】 可存在於該配製物及由彼等所導生之施用形式中之其他助劑包括染料如無機顏料，例如氧化鐵、氧化鈦及普魯士藍，及有機染料如茜素染料、偶氮染料及金屬鈦花青染料，及營養物及微量養分如鐵、錳、硼、銅、鈷、鉬及鋅之鹽類。

【0133】 附加之組份可為穩定劑，如冷穩定劑、防腐劑、抗氧化劑、光穩定劑，或改進化學及/或物理穩定性之其他試劑。泡沫形成劑或防沫劑亦可存在。

【0134】 此外，該配製物及由彼等所衍生之使用形式亦可包括，如附加之助劑、黏劑如羧基甲基纖維素及以粉末、顆粒或乳膠形式之天然及合成聚合物，如阿拉伯樹膠、聚乙烯醇及聚醋酸乙烯酯，或者天然磷脂如腦磷脂及卵磷脂，及合成磷脂。其他可能之助劑包括礦物油及植物油。

【0135】 其他助劑可任意存在於該配製物及由彼等所導生之使用形式中。此等添加物之實例包括香氣、保護膠體、黏合劑、膠黏劑、增稠劑、觸變性劑、滲透劑、保留促進劑、穩定劑、多價螯合劑、絡合劑、濕潤劑、擴展劑。一般而言，式(I)化合物可與常用於配製目

的上之任何固態或液態添加物組合。

【0136】 有用的保留促進劑包括所有那些降低動態表面張力，例如磺基琥珀酸二辛酯，或增加黏彈性，例如羥基丙基樹膠酯聚合物之物質。

【0137】 於本發明之內文中，有用的滲透劑為所有那些其典型係為了改善活性農化組成份穿透至植物中而使用之物質。於本內文中滲透劑係以其等能夠由該施用液體(通常含水)及/或由該噴霧塗層穿透該植物之角質層且因而增加該活性組成份於角質層中之流動性之能力而定義。該特性可用文獻(包爾等，1997，農藥科學 51，131-152)中所說明之方法來測定。實例包括醇烷氧化物，如椰基脂肪酸乙氧化物(10)或異十三基乙氧化物(12)、脂肪酸酯類，如油菜籽油甲基酯或大豆油甲基酯、脂肪族胺烷氧化物，例如牛脂胺乙氧化物(15)，或銨及/或鏻鹽，例如硫酸銨或磷酸氫二銨。

【0138】 該配製物較佳含有式(I)化合物之 0.00000001%及 98%按重量之間，更佳式(I)化合物之 0.01%及 95%按重量之間，最佳式(I)化合物之 0.5%及 90%按重量之間，以該配製物之重量計。

【0139】 式(I)化合物之內容物於由該配製物(尤其農藥)所製備之使用形式中，可於廣大之範圍內變化。於使用形式中之式(I)化合物的濃度可典型地於式(I)化合物之 0.00000001%及 95%按重量之間，較佳於 0.00001%及 1%按重量之間，以該使用形式之重量計。施用係以適合於該使用形式之習用方式來完成。

【0140】 式(I)化合物亦可用於含有一種或多種適當之殺真菌劑、殺細菌劑、殺蟎蟲劑、殺軟體動物劑、殺線蟲劑、殺昆蟲劑、微生物、有益生物、除莠劑、肥料、驅鳥劑、植物毒性物(phytotonics)、消毒劑、安全劑、化學信息素及/或植物生長調節劑之混合物中，以便因此，例如，擴大作用譜，延長作用之持續時間，提高作用速率，防止排斥作用或避免抗性演變。此外，此種活性組成份組合物可改良植物生長及/或對非生物因子，例如高或低溫，對乾旱或對提高含水量或土壤含鹽量之耐受性。亦可改良開花及結實性能，優化發芽能力及根系發展，方便收穫及提高產率，影響成熟，提高品質及/或收

穫產物之營養價值，延長儲藏期及/或改良收穫產物之可加工性。

【0141】 此外，該式(I)化合物可於含有其他活性組成份或化學信息素，如誘捕劑及/或驅鳥劑及/或植物活化劑及/或生長調節劑及/或肥料之混合物中存在。同樣，該式(I)化合物可於含有用於改良植物性質，例如收穫材料之生長、產量及品質之試劑的混合物中使用。

【0142】 於本發明之特別具體例中，式(I)化合物係以配製物形式或由此等配製物所製備之使用形式，與另外的化合物，較佳那些如說明於下者於混合物中。

【0143】 若一種於下所提化合物可以多種互變異構體形式發生，即使沒有於每一情況中明確地提到亦將包括此等形式。

殺昆蟲劑/殺蟎蟲劑/殺線蟲劑

【0144】 於本文中以其等之「通用名稱」指定之活性組成份係為已知且說明於，例如，農藥手冊，第 16 版，英國作物保護委員會 2012 中，或可於該網路中搜尋(例如 http://www.alanwood.net/ pesticides)。

(1) 乙醯膽鹼酯酶(AChE)抑制劑類，例如胺基甲酸酯，例如阿蘭克(alanycarb)、得滅克(aldicarb)、苯代克(bendiocarb)、苯代克((benfuracarb)、丁卡波辛(butocarboxim)、丁氧卡波辛(butoxycarboxim)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbo 呋喃)、加保殺芬(carbosulfan)、伊殺芬克(ethiofencarb)、芬諾布克(fenobucarb)、覆滅蟎(formetanate)、弗噻克(furathiocarb)、異普克(isoprocarb)、滅賜克(methiocarb)、美索乃(methomyl)、美脫克(metolcarb)、歐殺滅(oxamyl)、皮米克(pirimicarb)、普波索(propoxur)、硫敵克(thiodicarb)、噻芬諾(thiofanox)、三雜滅(triazamate)、三滅克(trimethacarb)、XMC 及塞利克(xylylcarb)；或有機磷酸化物，例如歐殺松(acephate)、氮雜滅塞磷(azamethiphos)、保棉磷(azinphos) -乙基、保棉磷-甲基、硫線磷(cadusafos)、氯乙氧磷(chlorethoxyfos)、克芬松(chlorfenvinphos)、克芬松(chlormephos)、氯吡磷(chlorpyrifos)、氯吡磷-甲基、庫馬磷(coumaphos)、氰乃松(cyanophos)、地滅通(demeton)-S-甲基、代淨農(diazinon)、二氯松(dichlorvos)/DDVP、代克脫磷(dicrotophos)、大滅

松(dimethoate)、二甲凡磷(dimethylvinphos)、二硫松(disulfoton)、EPN、愛殺松(ethion)、滅線磷(ethoprophos)、凡弗(famphur)、芬滅松(fenamiphos)、撲滅松(fenitrothion)、芬松(fenthion)、噻唑磷(fosthiazate)、庚諾磷(heptenophos)、庚諾磷(imicyafos)、異芬磷(isofenphos)、O-(甲氧基胺基硫基磷醯)水楊酸異丙酯、異殺松(isoxathion)、馬拉松(malathion)、馬拉松(mecarbam)、達馬松(methamidophos)、殺撲磷(methidathion)、滅威磷(mevinphos)、單克磷(monocrotophos)、乃力得(naled)、歐滅松(omethoate)、氧地滅通-甲基(oxydemeton-m 乙基)、巴拉松(parathion)、巴拉松-甲基、芬達松(phenthoate)、福瑞松(phorate)、福殺隆(phosalone)、福滅(phosmet)、福發滅(phosphamidon)、磷辛(phoxim)、必利磷(pirimiphos)-甲基、佈飛磷(profenofos)、普比達磷(propetamphos)、普比達磷(prothiofos)、吡克磷(pyraclofos)、必芬松(pyridaphenthion)、奎納磷(quinalphos)、殺弗特(sulfotep)、特布比磷(tebupirimfos)、特滅磷(temephos)、特丁硫磷(terbufos)、四氯威磷(tetrachlorvinphos)、塞滅通(thiometon)、三落磷(triazophos)、三氯松(triclorfon)及凡米多松(vamidothion)。

(2) GABA-選通之氯道拮抗劑類，例如環二烯有機氯，例如氯丹(chlordane)及安殺番(endosulfan)或苯基吡唑(飛普落(fiproles))，例如乙普落(ethiprole)及芬普尼(fipronil)。

(3) 鈉道調製劑類/電壓依賴鈉道阻斷劑類，擬除蟲菊酯，例如氟丙菊酯、丙烯菊酯(allethrin)、d-順式-反式丙烯菊酯、d-反式丙烯菊酯、聯苯菊酯(bifenthrin)、生物丙烯菊酯、生物丙烯菊酯 S-環戊烯基異構體、生物苄呋菊酯(bioresmethrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、塞扶寧(cyfluthrin)、β-塞扶寧、氯氟氰菊酯(cyhalothrin)、λ-氯氟氰菊酯、γ-氯氟氰菊酯、氯氰菊酯、α-氯氰菊酯、β-氯氰菊酯、θ-氯氰菊酯、ζ-氯氰菊酯、塞芬寧(cyphenothrin)[(1R)-反式異構體]、達滅寧(deltamethrin)、安潘寧(empenthrin) [(EZ)-(1R)異構體]、高氰戊菊酯、醚菊酯、甲氰菊酯、氰戊菊酯、氟氰戊菊酯(flucythrinate)、扶滅寧(flumethrin)、氟胺氰菊酯(tau-fluvalinate)、苄螨醚(halfenprox)、炔咪菊酯、噻嗯菊酯(kadethrin)、百滅寧(permethrin)、苯醚菊酯(phenothrin)

S

[(1R)-反式異構體]、丙炔菊酯、除蟲菊酯(除蟲菊)、苄呋菊酯、氟矽菊酯、胺菊酯(tefluthrin)、似蟲菊(tetramethrin)、似蟲菊[(1R)異構體)]、四溴菊酯(tralomethrin)及四氟苯菊酯(transfluthrin)或 DDT 或甲氧基氯。

(4) 菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)激動劑，例如類新菸鹼(neonicotinoids)，例如亞滅培(acetamiprid)、噻蟲胺(clothianidin)、呋蟲胺(dinotefuran)、益達胺(imidacloprid)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、噻蟲啉(thiacloprid)及塞速安(thiamethoxam)或菸鹼或氟啶蟲胺腈(sulfoxaflor)。

(5) 菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)之別構活化劑類，例如賜諾殺(spinosyns)，例如乙基多殺菌素(spinetoram)及多殺菌素(spinosad)。

(6) 氯道活化劑類，例如奧佛麥菌素(avermectins)/米爾倍黴素(milbemycins)，例如阿維菌素(abamectin)、甲胺基阿維菌素苯甲酸鹽(emamectin benzoate)、雷皮菌素(lepimectin)及密滅汀(milbemectin)。

(7) 幼稚型荷爾蒙模擬物，例如幼稚型荷爾蒙類似物，例如烯蟲乙酯(hydroprene)、烯蟲炔酯(kinoprene)及甲氧普烯(methoprene)或苯氧威(fenoxycarb)或吡丙醚(pyriproxyfen)。

(8) 具有未知或非特定作用機制之活性組成份，例如烷基鹵化物，例如甲基溴化物及其他烷基鹵化物；或氯化苦(chloropicrine)或硫醯氟或硼砂或催吐酒石。

(9) 選擇性拒食劑，例如吡蚜酮(pymetrozine)或氟啶蟲醯胺(flonicamid)。

(10) 螨蟲生長抑制劑類，例如克芬螨(clofentezine)、噻螨酮(hexythiazox)及氟螨嗪(diflovidazin)或乙螨唑(etoxazole)。

(11) 昆蟲腸道膜之微生物斷離劑，例如蘇雲金芽孢桿菌以色列亞種、球形芽孢桿菌(Bacillus sphaericus)、蘇雲金芽孢桿菌鮎澤亞種、蘇雲金芽孢桿菌克斯塔亞種、蘇雲金芽孢桿菌擬步行蟲亞種，及 BT 植物蛋白質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab1。

(12) 氧化性磷酸化作用抑制劑類、ATP 斷離劑，例如丁醚脲(diafenthiuron)或有機錫化合物，例如三唑錫(azocyclotin)、三環錫(cyhexatin)及芬

布賜(fenbutatin oxide)或克蟎特(propargite)或得脫蟎(tetradifon)。

(13) 中斷 H 質子梯度之氧化性磷酸化作用非偶合劑類，例如蟲蟎腈(chlorfenapyr)、DNOC 及氟蟲胺(sulfluramid)。

(14) 菸鹼乙醯膽鹼受體阻斷劑，例如免速達(bensultap)、殺螟氫氯化物(cartap hydrochloride)、殺蟲環(thiocyclam)，及殺蟲雙(thiosultap-sodium)。

(15) 甲殼素生物合成抑制劑類，0 型，例如雙三氟蟲脲(bistrifluron)、定蟲隆(chlorfluazuron)、除蟲脲(diflubenzuron)、氟滿脲(flucycloxuron)、氟蟲脲(flufenoxuron)、六氟隆(hexaflumuron)、虱蟎脲(lufenuron)、諾伐隆(novaluron)、諾福隆(noviflumuron)、得福隆(teflubenzuron)及殺蟲隆(triflumuron)。

(16) 甲殼素生物合成抑制劑類，1 型，例如噻嗪酮(buprofezin)。

(17) 蛻皮抑制劑類(特別用於雙翅目)，亦即雙翅類昆蟲，例如滅蠅胺(cyromazine)。

(18) 蛻皮激素受體激動劑類，例如環蟲醯肼(chromafenozide)、氯蟲醯肼(halofenozide)、甲氧蟲醯肼(methoxyfenozide)及蟲醯肼(tebufenozide)。

(19) 鱆胺激動劑類，例如三亞蟎(amitraz)。

(20) 絡合物-III 電子輸送抑制劑類，例如氟蚊腙(hydramethylnon)；或滅蟎醌(acequinocyl)；或嘧蟎酯(fluacrypyrim)。

(21) 絡合物-I 電子輸送抑制劑類，例如來自於 METI 殺蟎蟲劑之群組，例如芬殺蟎(fenazaquin)、唑蟎酯(fenpyroximate)、嘧蟎醚(pyrimidifen)、速蟎酮(pyridaben)、吡蟎胺(tebufenpyrad)及唑蟲醯胺(tolfenpyrad)或魚藤酮(魚藤)。

(22) 電壓依賴鈉道阻斷劑類，例如茚蟲威(indoxacarb)或氰氟蟲腙(metaflumizone)。

(23) 乙醯-CoA 羧基酶抑制劑，例如季酮酸與二酮(tetramic acid)衍生物，例如螺蟎酯(spirodiclofen)、螺甲蟎酯(spiromesifen)及螺乙蟎酯(spirotetramat)。

(24) 絡合物-IV 電子輸送抑制劑類，例如膦類，例如磷化鋁、磷化鈣、

膦及鋅磷化物或氰化物。

(25) 絡合物-II 電子輸送抑制劑類，例如腈吡螨酯(cyenopyrafen)及丁氟螨酯(cyflumetofen)。

(28) 藍諾定(Ryanodine)受體作用子，例如二醯胺，例如氯蟲苯甲醯胺(chlorantraniliprole)、氰蟲醯胺(cyantraniliprole)及氟蟲雙醯胺(flubendiamide)。

其他活性組成份，例如氯醯草膦(afidopyropen)、印苦楝子素(azadirachtin)、苯氯噻(benclothiaz)、苯肟酸化物(benzoximate)、聯苯肼酯(bifenazate)、溴丙醇化物、螨離丹(chinomethionat)、冰晶石、大克螨(dicofol)、氟螨嗪(diflovidazin)、弗殺芳(fluensulfone)、弗美脫奎(flometoquin)、嘧蟲胺(flufenerim)、氟菌螨酯(flufenoxystrobin)、丁烯氟蟲腈(flufiprole)、氟吡菌醯胺(fluopyram)、弗哌第呋隆(flupyradifurone)、呋喃蟲醯肼(fufenozide)、庚氟寧(heptafluthrin)、米達克塞(imidaclothiz)、依普同(iprodione)、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、哌蟲啶(paichongding)、哌弗布埋(pyflubumide)、派弗喹松(pyrifluquinazon)、嘧螨胺(pyriminostrobin)、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)及碘甲烷；以及以堅強芽孢桿菌(Bacillus firmus)為底之製劑(I-1582，BioNeem，Votivo)，以及下列之化合物：3-溴-N-{2-溴-4-氯-6-[(1-環丙基乙基)胺基甲醯]苯基}-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-甲醯胺(已知於 WO2005/077934)及 1-{2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亞磺醯]苯基}-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺(已知於 WO2006/043635)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吲哚-3,4'-吡啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮(已知於 WO2003/106457)、2-氯-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]吡啶-4-基}-4-(三氟甲基)苯基]異菸醯胺(已知於 WO2006/003494)、3-(2,5-二甲基苯基)-4-羥基-8-甲氧基-1,8-二氮雜螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(已知於 WO2009/049851)、3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-酮基-1,8-二氮雜螺[4.5]癸-3-烯-4-基-乙基碳酸酯(已知於 WO2009/049851)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基吡啶-1-基)-5-氟嘧啶(已知於 WO2004/099160)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3-氯苯基)嘧啶(已知於 WO2003/076415)、PF1364 (CAS 登記號碼 1204776-60-2)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-{2-酮基

-2-[(2,2,2-三氟乙基)胺基]乙基}苯甲醯胺(已知於 WO2005/085216)、4-{5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基}-N-{2-酮基-2-[(2,2,2-三氟乙基)胺基]乙基}-1-萘醯胺(已知於 WO2009/002809)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基}胺基)-5-氯-3-甲基苯甲醯基]-2-甲肼羧酸甲酯(已知於 WO2005/085216)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基}胺基)-5-氰基-3-甲基苯甲醯基]-2-乙肼羧酸甲酯(已知於 WO2005/085216)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基}胺基)-5-氰基-3-甲基苯甲醯基]-2-甲肼羧酸甲酯(已知於 WO2005/085216)、2-[3,5-二溴-2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基}胺基)苯甲醯基]-2-乙肼羧酸甲酯(已知於 WO2005/085216)、1-(3-氯吡啶-2-基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-(甲基胺基甲醯)苯基]-3-{[5-(三氟甲基)-2H-四唑-2-基]甲基}-1H-吡唑-5-甲醯胺(已知於 WO2010/069502)、N-[2-(5-胺基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-甲醯胺(已知於 CN102057925)、3-氯-N-(2-氰基丙-2-基)-N-[4-(1,1,1,2,3,3,3-七氟丙-2-基)-2-甲基苯基]酞醯胺(已知於 WO2012/034472)、8-氯-N-[(2-氯-5-甲氧基苯基)磺醯]-6-(三氟甲基)咪唑[1,2-a]吡啶-2-甲醯胺(已知於 WO2010/129500)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-(1-氧撐噻坦-3-基)苯甲醯胺(已知於 WO2009/080250)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-(1-氧撐噻坦-3-基)苯甲醯胺(已知於 WO2012/029672)、1-[(2-氯-1,3-噻唑-5-基)甲基]-4-酮基-3-苯基-4H-吡啶並[1,2-a]嘧啶-1-鎓-2-醇鹽(已知於 WO2009/099929)、1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-4-酮基-3-苯基-4H-吡啶並[1,2-a]嘧啶-1-鎓-2-醇鹽(已知於 WO2009/099929)、(5S,8R)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-9-硝基-2,3,5,6,7,8-六氫-1H-5,8-環氧基咪唑[1,2-a]氮雜䓬(已知於 WO2010/069266)、(2E)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-N'-硝基-2-亞戊肼羧醯亞胺醯胺(已知於 WO2010/060231)、4-(3-{2,6-二氯-4-[(3,3-二氯丙-2-烯-1-基)氧基]苯氧基}丙氧基)-2-甲氧基-6-(三氟甲基)嘧啶(已知於 CN101337940)、N-[2-(第三-丁基胺基甲醯)-4-氯-6-甲基苯基]-1-(3-氯吡啶-2-基)-3-(氟甲氧基)-1H-吡唑-5-甲醯胺(已知於 WO2008/134969)。

殺真菌劑

【0145】 於本文中以其等之通用名稱指定之活性組成份係為已知且說明於，例如，「農藥手冊」中或於網路(例如：http：//www.alanwood.net/pesticides)。

(1) 麥角脂醇生物合成抑制劑類，例如，(1.1) 亞頂莫(aldimorph)，(1.2) 氮雜康唑(azaconazole)，(1.3) 拜特坦諾(bitertanol)，(1.4) 布妙康唑(bromuconazole)，(1.5) 希普康唑(cyproconazole)，(1.6) 二克布塔唑(diclobutrazole)，(1.7) 二芬康唑(difenoconazole)，(1.8) 二尼康唑(diniconazole)，(1.9) 二尼康唑-M，(1.10) 多定莫(dodemorph)，(1.11) 多定莫醋酸化物，(1.12) 艾歐康唑(epoxiconazole)，(1.13) 伊塔康唑(etaconazole)，(1.14) 芬瑞莫(fenarimol)，(1.15) 芬布康唑(fenbuconazole)，(1.16) 芬己邁(fenhexamid)，(1.17) 芬普比定(fenpropidin)，(1.18) 芬普福(fenpropimorph)，(1.19) 福坤康唑(fluquinconazole)，(1.20) 弗普米多(flurprimidol)，(1.21) 福喜唑(flusilazole)，(1.22) 福三佛(flutriafol)，(1.23) 富康唑(furconazole)，(1.24) 富康唑-順式，(1.25) 庚康唑(hexaconazole)，(1.26) 依滅列(imazalil)，(1.27) 依滅列硫酸鹽，(1.28) 咪苯康唑(imibenconazole)，(1.29) 依丕康唑(ipconazole)，(1.30) 美康唑(metconazole)，(1.31) 邁可布尼(myclobutanil)，(1.32) 納帝芬(naftifine)，(1.33) 奴里莫(nuarimol)，(1.34) 歐波康唑(oxpoconazole)，(1.35) 巴克布他唑(paclobutrazol)，(1.36) 沛夫唑(pefurazoate)，(1.37) 潘康唑(penconazole)，(1.38) 哌比拉寧(piperaline)，(1.39) 普氯拉(prochloraz)，(1.40) 丙康唑(propiconazole)，(1.41) 普塞康唑(prothioconazole)，(1.42) 哌布卡(pyributicarb)，(1.43) 吡芬殺(pyrifenox)，(1.44) 坤康唑(quinconazole)，(1.45) 希蜜康唑(simeconazole)，(1.46) 螺希胺(spiroxamine)，(1.47) 提賓康唑(tebuconazole)，(1.48) 特賓納芬(terbinafine)，(1.49) 四康唑(tetraconazole)，(1.50) 三第美奉(triadimefon)，(1.51) 三戴蒙歐(triadimenol)，(1.52) 三得福(tridemorph)，(1.53) 賽福唑(triflumizole)，(1.54) 賽福寧(triforine)，(1.55) 三惕康唑(triticonazole)，(1.56) 尤尼康唑(uniconazole)，(1.57) 尤尼康唑-P，(1.58) 維尼康唑

(viniconazole)，(1.59) 伏力康唑(voriconazole)，(1.60) 1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)環庚醇，(1.61) 1-(2,2-二甲基-2,3-二氫-1H-茚-1-基)-1H-咪唑-5-羧酸甲酯，(1.62) N'-{5-(二氟甲基)-2-甲基-4-[3-(三甲基矽烷基)丙氧基]苯基}-N-乙基-N-甲基亞胺甲醯胺，(1.63) N-乙基-N-甲基-N'-{2-甲基-5-(三氟甲基)-4-[3-(三甲基矽烷基)丙氧基]苯基}亞胺甲醯胺及(1.64) O-[1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁-2-基]-1H-咪唑-1-羧硫代酸酯，(1.65) 哌異噁唑(pyrisoxazole)。

(2) 呼吸抑制劑類(呼吸鏈抑制劑)，例如(2.1) 必殺芬(bixafen)，(2.2) 波卡利(boscalid)，(2.3) 卡波辛(carboxin)，(2.4) 二弗美脫林(diflumetorim)，(2.5) 芬呋嵐(fenfuram)，(2.6) 弗哌嵐(fluopyram)，(2.7) 弗多尼(flutolanil)，(2.8) 氟唑菌醯胺(fluxapyroxad)，(2.9) 福咪哌(furametpyr)，(2.10) 福美塞克(furmecyclox)，(2.11) 同-差向異構(epimeric)消旋物 1RS,4SR,9RS 與反-差向異構體消旋物 1RS,4SR,9SR 之福美塞克(furmecyclox)混合物，(2.12) 異哌拉殺(isopyrazam) (反-差向異構消旋物)，(2.13) 異哌拉殺(反-差向異構對映體 1R,4S,9S)，(2.14) 異哌拉殺(反-差向異構對映體 1S,4R,9R)，(2.15) 異哌拉殺(同-差向異構消旋物 1RS,4SR,9RS)，(2.16) 異哌拉殺(同-差向異構對映體 1R,4S,9R)，(2.17) 異哌拉殺(同-差向異構對映體 1S,4R,9S)，(2.18) 美普尼(mepronil)，(2.19) 氧卡波辛(oxycarboxin)，(2.20) 潘弗芬(penflufen)，(2.21) 戊硫哌(penthiopyrad)，(2.22) 西達散(sedaxane)，(2.23) 塞弗醯胺(thifluzamide)，(2.24) 1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-甲醯胺，(2.25) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-1H-吡唑-4-甲醯胺，(2.26) 3-(二氟甲基)-N-[4-氟-2-(1,1,2,3,3,3-六氟丙氧基)苯基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(2.27) N-[1-(2,4-二氯苯基)-1-甲氧基丙-2-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(2.28) 5,8-二氟-N-[2-(2-氟-4-{[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]氧基}苯基)乙基]喹唑啉-4-胺，(2.29) 苯芬弗哌(benzovindiflupyr)，(2.30) N-[(1S,4R)-9-(二氯亞甲基)-1,2,3,4-四氫-1,4-甲醯萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺及(2.31) N-[(1R,4S)-9-(二氯亞甲基)-1,2,3,4-四氫-1,4-甲醯萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(2.32) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基)-1H-

吡唑-4-甲醯胺，(2.33) 1,3,5-三甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基)-1H-吡唑-4-甲醯胺，(2.34) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基)-1H-吡唑-4-甲醯胺，(2.35) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基]-1H-吡唑-4-甲醯胺，(2.36) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基]-1H-吡唑-4-甲醯胺，(2.37) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基]-1H-吡唑-4-甲醯胺，(2.38) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基]-1H-吡唑-4-甲醯胺，(2.39) 1,3,5-三甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基]-1H-吡唑-4-甲醯胺，(2.40) 1,3,5-三甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基]-1H-吡唑-4-甲醯胺，(2.41) 免丹奈(benodanil)，(2.42) 2-氯-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基)吡啶-3-甲醯胺，(2.43) 艾索費米(Isofetamid)。

(3) 於呼吸鏈之絡合物III上作用之呼吸抑制劑類(呼吸鏈抑制劑)，例如，阿米脫他定(ametoctradin)，(3.2) 安咪沙布(amisulbrom)，(3.3) 亞托敏(azoxystrobin)，(3.4) 辛若密(cyazofamid)，(3.5) 庫莫託敏(coumethylstrobin)，(3.6) 可莫託敏(coumoxystrobin)，(3.7) 定氧史託敏(dimoxystrobin)，(3.8) 烯肟菌酯(enestroburin)，(3.9) 發幕酮(famoxadone)，(3.10) 芬醯胺酮(fenamidone)，(3.11) 氟菌螨酯(Flufenoxystrobin)，(3.12) 福辛託敏(fluoxastrobin)，(3.13) 芮索欽(kresoxim)-甲基，(3.14) 咪蜜史託敏(metominostrobin)，(3.15) 歐撒史託敏(orysastrobin)，(3.16) 皮氧史託敏(picoxystrobin)，(3.17) 百克託敏(pyraclostrobin)，(3.18) 派米史託敏(pyrametostrobin)，(3.19) 派氧史託敏(pyraoxystrobin)，(3.20) 派利苯卡(pyribencarb)，(3.21) 三可哌克(triclopyricarb)，(3.22) 三夫氧基史託敏(trifloxystrobin)，(3.23) (2E)-2-(2-{[6-(3-氯-2-甲基苯氧基)-5-氟嘧啶-4-基]氧基}苯基)-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基乙醯胺，(3.24) (2E)-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基-2-(2-{[({(1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亞乙基}胺基)氧基]甲基}苯基)乙醯胺，(3.25) (2E)-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基-2-{2-[(E)-({1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基}亞胺基)甲基]苯基}乙醯胺，(3.26) (2E)-2-{2-[({[(1E)-1-(3-{[(E)-1-氟-2-苯基乙烯基]氧基}苯基)亞乙基]胺基}氧基)甲基]苯基}-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基乙醯胺，(3.27)

(2E)-2-{2-[({[(2E,3E)-4-(2,6-二氯苯基)丁-3-烯-2-亞基]胺基}氧基)甲基]苯基}-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基乙醯胺，(3.28) 2-氯-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基)吡啶-3-甲醯胺，(3.29) 5-甲氧基-2-甲基-4-(2-{[({(1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亞乙基}胺基)氧基]甲基}苯基)-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-酮，(3.30) (2E)-2-{2-[({環丙基[(4-甲氧基苯基)亞胺基]甲基}硫烷基)甲基]苯基}-3-甲氧基丙-2-烯酸甲酯，(3.31) N-(3-乙基-3,5,5-三甲基環己基)-3-(甲醯胺基)-2-羥基苯甲醯胺，(3.32) 2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙醯胺。

(4) 有絲分裂及細胞分裂之抑制劑，例如(4.1) 免賴得(benomyl)，(4.2) 加苯達辛(carbendazim)，(4.3) 氯芬唑(chlorfenazole)，(4.4) 二蘇芬克(diethofencarb)，(4.5) 艾殺波散(ethaboxam)，(4.6) 弗皮克(fluopicolide)，(4.7) 夫柏達唑(fuberidazole)，(4.8) 賓克隆(pencycuron)，(4.9) 噻菌靈(thiabendazole)，(4.10) 甲基多保淨(Thiophanate-methyl)，(4.11) 多保淨(thiophanate)，(4.12) 茹散醯胺(zoxamide)，(4.13) 5-氯-7-(4-甲基吡啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑 o[1,5-a]嘧啶及(4.14) 3-氯-5-(6-氯吡啶-3-基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)嗒卅。

(5) 具有多位點活性之化合物，例如，(5.1) 波爾多混合液，(5.2) 卡他福(captafol)，(5.3) 卡普丹(captan)，(5.4) 百菌清(chlorothalonil)，(5.5) 銅製劑如氫氧化銅，(5.6) 環烷酸銅，(5.7) 氧化銅，(5.8) 氯氧化銅，(5.9) 硫酸銅，(5.10) 二氯呋尼(dichlofluanid)，(5.11) 二噻農(dithianon)，(5.12) 多果定(dodine)，(5.13) 多果定游離鹼，(5.14) 費班(ferbam)，(5.15) 氟福爾丹(fluorofolpet)，(5.16) 福爾丹(folpet)，(5.17) 瓜惹汀(guazatine)，(5.18) 瓜惹汀醋酸化物，(5.19) 雙胍辛胺(iminoctadine)，(5.20) 雙胍辛胺阿貝雷(iminoctadine albesilate)，(5.21) 雙胍辛胺三醋酸化物(iminoctadine triacetate)，(5.22) 曼銅(mancopper)，(5.23) 鋅錳乃浦(mancozeb)，(5.24) 曼滅(maneb)，(5.25) 咪泰芮(metiram)，(5.26) 咪泰芮鋅(zinc metiram)，(5.27) 喹啉銅(copper-oxine)，(5.28) 普羅帕脒(propamidine)，(5.29) 甲基代森鋅(propineb)，(5.30) 硫與硫製劑，例如多硫化鈣，(5.31) 福美雙(thiram)，(5.32) 對甲抑菌靈(tolylfluanid)，(5.33) 鋅乃浦(zineb)，(5.34) 福美鋅(ziram)，及(5.35) 敵菌靈(anilazine)。

(6) 抗性誘導劑類，例如，(6.1) 埃苯拉(acibenzolar)-S-甲基，(6.2) 異汰尼(isotianil)，(6.3) 噻菌靈(probenazole)，(6.4) 噻醯菌胺(tiadinil)及(6.5) 昆布糖。

(7) 胺基酸與蛋白質生物合成抑制劑類，例如，(7.1)，(7.2) 殺稻瘟菌素-S，(7.3) 嘧菌環胺(cyprodinil)，(7.4) 春日黴素，(7.5) 春日黴素氫氯化物水合物，(7.6) 嘧菌胺(mepanipyrim)，(7.7) 嘧黴胺(pyrimethanil)，(7.8) 3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)喹啉及(7.9) 土黴素(oxytetracycline)及(7.10) 鏈黴素。

(8) ATP 產生抑制劑類，例如，(8.1) 三苯錫(fentin)醋酸化物，(8.2) 三苯錫氯化物，(8.3) 三苯錫氫氧化物及(8.4) 矽噻菌胺(silthiofam)。

(9) 細胞壁合成抑制劑類，例如，(9.1) 苯噻菌胺(benthiavalicarb)，(9.2) 烯醯嗎啉(dimethomorph)，(9.3) 弗莫(flumorph)，(9.4) 丙森鋅(iprovalicarb)，(9.5) 曼普胺(mandipropamid)，(9.6) 保粒辛(polyoxins)，(9.7) 保利索(polyoxorim)，(9.8) 維利黴素 A (validamycin A)，(9.9) 維利芬那(valifenalate)及(9.10) 保粒辛 B。

(10) 脂質與膜合成抑制劑類，例如，(10.1) 聯苯基，(10.2) 地茂散(chloroneb)，(10.3) 代克嵐(dicloran)，(10.4) 迪芬弗(edifenphos)，(10.5) 依得利(etridiazole)，(10.6) 碘克(iodocarb)，(10.7) 伊普苯弗(iprobenfos)，(10.8) 異普塞藍(isoprothiolane)，(10.9) 普拔克(propamocarb)，(10.10) 普拔克氫氯化物，(10.11) 普塞克(prothiocarb)，(10.12) 吡唑松(pyrazophos)，(10.13) 五氯硝苯(quintozene)，(10.14) 得納辛(tecnazene)及(10.15) 脫克松-甲基(tolclofos-methyl)。

(11) 黑素生物合成抑制劑類，例如，(11.1) 卡普邁(carpropamid)，(11.2) 代克塞滅(diclocymet)，(11.3) 芬諾殺(fenoxanil)，(11.4) 費殺來(phthalide)，(11.5) 派克隆(pyroquilon)，(11.6) 三塞唑(tricyclazole)及(11.7) 2,2,2-三氟乙基{3-甲基-1-[(4-甲基苯甲醯基)胺基]丁-2-基}胺基甲酸酯。

(12) 核酸合成抑制劑類，例如，(12.1) 苯納拉昔(benalaxyl)，(12.2) 苯納拉昔-M (克拉殺(kiralaxyl))，(12.3) 布比滅(bupirimate)，(12.4) 克洛西拉康(clozylacon)，(12.5) 代滅利摩(dimethirimol)，(12.6) 艾西利摩(ethirimol)，(12.7) 福瑞拉昔(furalaxyl)，(12.8) 海美殺松(hymexazole)，(12.9) 滅達樂

(metalaxyl)，(12.10) 滅達樂-M (滅芬殺(mefenoxam))，(12.11) 歐弗拉斯(ofurace)，(12.12) 毆殺斯(oxadixyl)，(12.13) 喔喹酸(oxolinic acid)及(12.14) 辛塞利農(octhilinone)。

(13) 信號轉導抑制劑類，例如，(13.1) 乙菌利(chlozolinate)，(13.2) 芬匹可尼(fenpiclonil)，(13.3) 福迪松尼(fludioxonil)，(13.4) 依普同(iprodione)，(13.5) 撲滅寧(procymidone)，(13.6) 奎諾殺芬(quinoxyfen)，(13.7) 威洛靈(vinclozolin)及(13.8) 普奎納西(proquinazid)。

(14) 去偶合劑，例如，(14.1) 必那巴克(binapacryl)，(14.2) 代諾卡(dinocap)，(14.3) 非林松(ferimzone)，(14.4) 福辛南(fluazinam)及(14.5) 美替代諾卡(meptyldinocap)。

(15) 另外的化合物，例如，(15.1) 苯噻唑，(15.2) 貝索咔(bethoxazin)，(15.3) 卡普希黴素(capsimycin)，(15.4) 香芹酮，(15.5) 蟎離丹(chinomethionat)，(15.6) 哌芬農(pyriofenone) (氯芬酮(chlazafenone))，(15.7) 克弗奈(cufraneb)，(15.8) 塞弗芬納(cyflufenamid)，(15.9) 塞滅殺(cymoxanil)，(15.10) 塞普殺胺(cyprosulfamide)，(15.11) 達松滅(dazomet)，(15.12) 迪巴克(debacarb)，(15.13) 二氯苯，(15.14) 達滅淨(diclomezine)，(15.15) 燕麥枯(difenzoquat)，(15.16) 燕麥枯利馬唑甲硫酸鹽(difenzoquat metilsulfate)，(15.17) 二苯胺，(15.18) 艾克滅(EcoMate)，(15.19) 芬哌殺(fenpyrazamine)，(15.20) 弗美脫(flumetover)，(15.21) 唑呋草(fluoroimid)，(15.22) 弗殺胺(flusulfamide)，(15.23) 弗替尼(flutianil)，(15.24) 三乙膦酸鋁(fosetyl-aluminium)，(15.25) 三乙膦酸鈣，(15.26) 三乙膦酸鈉，(15.27) 六氯苯，(15.28) 人間黴素(irumamycin)，(15.29) 磺滅威(methasulfocarb)，(15.30) 異硫氰酸甲酯，(15.31) 苯菌酮(metrafenone)，(15.32) 米多黴素(mildiomycin)，(15.33) 納他黴素(natamycin)，(15.34) 二甲基二硫基胺基甲酸鎳，(15.35) 異丙消(nitrothal-isopropyl)，(15.36) 辛噻酮(octhilinone)，(15.37) 毆殺莫克(oxamocarb)，(15.38) 毆芬辛(oxyfenthiin)，(15.39) 五氯酚及其之鹽類，(15.40) 芬諾寧(phenothrin)，(15.41) 磷酸及其之鹽類，(15.42) 霜黴威乙膦酸鹽(propamocarb-fosetylate)，(15.43)普本辛-鈉(propanosine-sodium)，(15.44) 哌利莫(pyrimorph)，(15.45) (2E)-3-(4-第三-丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(嗎福啉-4-基)丙-2-烯-1-酮，(15.46)

(2Z)-3-(4-第三-丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(嗎福啉-4-基)丙-2-烯-1-酮，(15.47) 硝吡咯菌素(pyrrolnitrin)，(15.48) 特布弗寧(tebufloquin)，(15.49) 葉枯酞(tecloftalam)，(15.50) 妥尼芬奈(tolnifanide)，(15.51) 三唑磷(triazoxide)，(15.52) 楊菌胺(trichlamide)，(15.53) 氰菌胺(zarilamid)，(15.54) (3S,6S,7R,8R)-8-苄基-3-[({3-[(異丁醯氧基)甲氧基]-4-甲氧基吡啶-2-基}羰基)胺基]-6-甲基-4,9-二酮基-1,5-二噁茂烷-7-基 2-甲基丙酸酯，(15.55) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}吡啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙烷酮，(15.56) 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}吡啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙烷酮，(15.57) 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}吡啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙烷酮，(15.58) 1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁-2-基 1H-咪唑-1-羧酸酯，(15.59) 2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺醯)吡啶，(15.60) 2,3-二丁基-6-氯噻吩並[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮，(15.61) 2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二硫並[2,3-c:5,6-c']二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮，(15.62) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[(5R)-5-苯基-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}吡啶-1-基)乙烷酮，(15.63) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[(5S)-5-苯基-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}吡啶-1-基)乙烷酮，(15.64) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-{4-[4-(5-苯基-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基)-1,3-噻唑-2-基]吡啶-1-基}乙烷酮，(15.65) 2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4H-色烯-4-酮，(15.66) 2-氯-5-[2-氯-1-(2,6-二氟-4-甲氧基苯基)-4-甲基-1H-咪唑 l-5-基]吡啶，(15.67) 2-苯基酚及鹽類，(15.68) 3-(4,4,5-三氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)喹啉，(15.69) 3,4,5-三氯吡啶-2,6-二甲腈，(15.70) 3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基嗒吡，(15.71) 4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基嗒吡，(15.72) 5-胺基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇，(15.73) 5-氯-N'-苯基-N'-(丙-2-炔-1-基)噻吩-2-磺醯肼，(15.74) 5-氟-2-[(4-氟苄基)氧基]嘧啶-4-胺，(15.75) 5-氟-2-[(4-甲基苄基)氧基]嘧啶-4-胺，(15.76) 5-甲基-6-辛基[1,2,4]三唑並[1,5-a]嘧啶-7-胺，(15.77) (2Z)-3-胺基-2-氰基-3-苯基丙烯酸乙酯，(15.78) N'-(4-{[3-(4-氯苄基)-1,2,4-噻二唑-5-基]氧基}-2,5-二甲

基苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺甲醯胺，(15.79) N-(4-氯苄基)-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]丙醯胺，(15.80) N-[(4-氯苯基)(氰基)甲基]-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]丙醯胺，(15.81) N-[(5-溴-3-氯吡啶-2-基)甲基]-2,4-二氯菸醯胺，(15.82) N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯菸醯胺，(15.83) N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2-氟-4-碘菸醯胺，(15.84) N-{(E)-[(環丙基甲氧基)亞胺基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苯基乙醯胺，(15.85) N-{(Z)-[(環丙基甲氧基)亞胺基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苯基乙醯胺，(15.86) N'-{4-[(3-第三-丁基-4-氰基-1,2-噻唑-5-基)氧基]-2-氯-5-甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亞胺甲醯胺，(15.87) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯}吡啶-4-基)-N-(1,2,3,4-四氫萘-1-基)-1,3-噻唑-4-甲醯胺，(15.88) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯}吡啶-4-基)-N-[(1R)-1,2,3,4-四氫萘-1-基]-1,3-噻唑-4-甲醯胺，(15.89) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯}吡啶-4-基)-N-[(1S)-1,2,3,4-四氫萘-1-基]-1,3-噻唑-4-甲醯胺，(15.90) {6-[({[(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亞甲基]胺基}氧基)甲基]吡啶-2-基}胺基甲酸戊酯，(15.91) 啡𠯿-1-羧酸，(15.92) 喹啉-8-醇，(15.93) 喹啉-8-醇硫酸酯(2：1)，(15.94) {6-[({[(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亞甲基]胺基}氧基)甲基]吡啶-2-基}胺基甲酸第三-丁酯，(15.95) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[2'-(三氟甲基)聯苯基-2-基]-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.96) N-(4'-氯聯苯基-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.97) N-(2',4'-二氯聯苯基-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.98) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(三氟甲基)聯苯基-2-基]-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.99) N-(2',5'-二氟聯苯基-2-基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.100) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)聯苯基-2-基]-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.101) 5-氟-1,3-二甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)聯苯基-2-基]-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.102) 2-氯-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)聯苯基-2-基]菸醯胺，(15.103) 3-(二氟甲基)-N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)聯苯基-2-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.104) N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)聯苯基-2-基]-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.105) 3-(二氟甲基)-N-(4'-乙炔基聯苯基-2-基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，

(15.106) N-(4'-乙炔基聯苯基-2-基)-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.107) 2-氯-N-(4'-乙炔基聯苯基-2-基)菸醯胺，(15.108) 2-氯-N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)聯苯基-2-基]菸醯胺，(15.109) 4-(二氟甲基)-2-甲基-N-[4'-(三氟甲基)聯苯基-2-基]-1,3-噻唑-5-甲醯胺，(15.110) 5-氟-N-[4'-(3-羥基-3-甲基丁-1-炔-1-基)聯苯基-2-基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.111) 2-氯-N-[4'-(3-羥基-3-甲基丁-1-炔-1-基)聯苯基-2-基]菸醯胺，(15.112) 3-(二氟甲基)-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)聯苯基-2-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.113) 5-氟-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)聯苯基-2-基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.114) 2-氯-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)聯苯基-2-基]菸醯胺，(15.115) (5-溴-2-甲氧基-4-甲基吡啶-3-基)(2,3,4-三甲氧基-6-甲基苯基)甲酮，(15.116) N-[2-(4-{[3-(4-氯苯基)丙-2-炔-1-基]氧基}-3-甲氧基苯基)乙基]-N2-(甲基磺醯)纈胺醯胺(valinamide)，(15.117) 4-酮基-4-[(2-苯基乙基)胺基]丁酸，(15.118) 丁-3-炔-1-基{6-[({[(Z)-(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亞甲基]胺基}氧基)甲基]吡啶-2-基}胺基甲酸酯，(15.119) 4-胺基-5-氟嘧啶-2-醇(互變異構體形式：4-胺基-5-氟嘧啶-2(1H)-酮)，(15.120) 3,4,5-三羥基苯甲酸丙酯，(15.121) 1,3-二甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基)-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.122) 1,3-二甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基]-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.123) 1,3-二甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基]-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.124) [3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇，(15.125) (S)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇，(15.126) (R)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇，(15.127) 2-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(15.128) 1-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯，(15.129) 5-(烯丙基硫烷基)-1-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑，(15.130) 2-[1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(15.131) 2-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(15.132)

2-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(15.133) 1-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯，(15.134) 1-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯，(15.135) 5-(烯丙基硫烷基)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑，(15.136) 5-(烯丙基硫烷基)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑，(15.137) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(15.138) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(15.139) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(15.140) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(15.141) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(15.142) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(15.143) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(15.144) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮，(15.145) 2-氟-6-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基)苯甲醯胺，(15.146) 2-(6-苄基吡啶-2-基)喹唑啉，(15.147) 2-[6-(3-氟-4-甲氧基苯基)-5-甲基吡啶-2-基]喹唑啉，(15.148) 3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)喹啉，(15.149) 離酸(abscisic acid)，(15.150) 3-(二氟甲基)-N-甲氧基-1-甲基-N-[1-(2,4,6-三氯苯基)丙-2-基]-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.151) N'-[5-溴-6-(2,3-二氫-1H-茚-2-基氧基)-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基亞胺甲醯胺，(15.152) N'-{5-溴-6-[1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}- N-乙基-N-甲基亞胺甲醯胺，(15.153) N'-{5-溴-6-[(1R)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺甲醯胺，(15.154) N'-{5-溴-6-[(1S)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺

甲醯胺，(15.155) N'-{5-溴-6-[(順式-4-異丙基環己基)氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺甲醯胺，(15.156) N'-{5-溴-6-[(反式-4-異丙基環己基)氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺甲醯胺，(15.157) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-異丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.158) N-環丙基-N-(2-環丙基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.159) N-(2-第三-丁基苄基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.160) N-(5-氯-2-乙基苄基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.161) N-(5-氯-2-異丙基苄基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.162) N-環丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-氟苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.163) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(5-氟-2-異丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.164) N-環丙基-N-(2-環丙基-5-氟苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.165) N-(2-環戊基-5-氟苄基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.166) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-氟-6-異丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.167) N-環丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.168) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-異丙基-5-甲基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.169) N-環丙基-N-(2-環丙基-5-甲基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.170) N-(2-第三-丁基-5-甲基苄基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.171) N-[5-氯-2-(三氟甲基)苄基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.172) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-N-[5-甲基-2-(三氟甲基)苄基]- 1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.173) N-[2-氯-6-(三氟甲基)苄基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.174) N-[3-氯-2-氟-6-(三氟甲基)苄基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.175) N-環丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-4,5-二甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.176) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-異丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧硫代醯胺，(15.177) 3-(二氟甲基)-N-(7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.178) 3-(二氟甲基)-N-[(3R)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-

茚-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.179) 3-(二氟甲基)-N-[(3S)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺，(15.180) N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺甲醯胺，(15.181) N'-{4-[(4,5-二氯-1,3-噻唑-2-基)氧基]-2,5-二甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亞胺甲醯胺，(15.182) N-(4-氯-2,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺。於(1)至(15)類中所提到之所有的混合成份，視情況而定可與適當鹼或酸形成鹽類，若彼等能夠於其等之官能基基礎上如此做。

生物農藥作為混合組份

【0146】 該式(I)化合物可與生物農藥合併。

【0147】 生物農藥包括，尤其細菌、真菌、酵母菌、植物萃出物及由微生物所形成之產品，包括蛋白質及次級代謝產物。

【0148】 生物農藥包括細菌，如產孢細菌、根菌落細菌及作用如生物殺昆蟲劑、殺真菌劑或殺線蟲劑之細菌。

【0149】 此等細菌用於或可用作為生物農藥之實例為：

液化澱粉芽胞桿菌(Bacillus amyloliquefaciens)，品系 FZB42 (DSM 231179)，或仙人掌桿菌(Bacillus cereus)，尤其仙人掌桿菌品系 CNCM I-1562 或堅強芽孢桿菌(Bacillus firmus)，品系 I-1582 (登錄號碼 CNCM I-1582)或短小芽胞桿菌(Bacillus pumilus)，尤其品系 GB34 (登錄號碼 ATCC 700814)及品系 QST2808 (登錄號碼 NRRL B-30087)，或枯草桿菌(Bacillus subtilis)，尤其品系 GB03 (登錄號碼 ATCC SD-1397)，或枯草桿菌品系 QST713 (登錄號碼 NRRL B-21661)或枯草桿菌品系 OST 30002 (登錄號碼 NRRL B-50421)蘇雲金芽孢桿菌，尤其，蘇雲金芽孢桿菌克斯塔亞種(血清類型 H-14)，品系 AM65-52 (登錄號碼 ATCC 1276)，或蘇雲金芽孢桿菌鮎澤亞種，尤其品系 ABTS-1857 (SD-1372)，或蘇雲金芽孢桿菌克斯塔亞種品系 HD-1，或蘇雲金芽孢桿菌擬步行蟲亞種品系 NB 176 (SD-5428)、穿刺巴氏桿菌(Pasteuria penetrans)、巴斯德氏菌(美國免除農藥巴斯德菌屬)-PR3 (登錄號碼 ATCC SD-5834)，細黃鏈黴菌(Streptomyces microflavus)品系 AQ6121 (= QRD 31.013，NRRL B-50550)、鮮黃鏈

黴菌(Streptomyces galbus)品系 AQ 6047 (登錄號碼 NRRL 30232)。

【0150】 真菌及酵母菌用於或可用作為生物農藥之實例為：

球孢白僵菌，尤其品系 ATCC 74040、真菌盾殼黴(Coniothyrium minitans)，尤其品系 CON/M/91-8 (登錄號碼 DSM-9660)、蚧黴(Lecanicillium spp.)，尤其品系 HRO LEC 12、真菌蠟蚧菌(Lecanicillium lecanii)(以前稱為蠟蚧輪枝菌(Verticillium lecanii))，尤其品系 KV01、金龜子綠僵菌(Metarhizium anisopliae)，尤其品系 F52 (DSM3884/ ATCC 90448)、核果梅奇酵母(Metschnikowia fructicola)，尤其品系 NRRL Y-30752、玫烟色擬青黴(Paecilomyces fumosoroseus) (現在：棒束孢(Isaria fumosorosea))，尤其品系 IFPC 200613，或品系 Apopka 97 (登錄號碼 ATCC 20874)、淡紫擬青黴(Paecilomyces lilacinus)，尤其淡紫擬青黴品系 251 (AGAL 89/030550)、黃藍狀菌，尤其品系 V117b、深綠木黴，尤其品系 SC1 (登錄號碼 CBS 122089)、哈茨木黴(Trichoderma harzianum)，尤其里氏哈茨木黴(T. harzianum rifai) T39 (登錄號碼 CNCM I-952)。

【0151】 病毒用於或可用作為生物農藥之實例為：

棉褐帶卷蛾(小卷蛾黃斑卷葉蛾)顆粒症病毒(GV)、蘋果蠹蛾(幼果蛾)顆粒症病毒(GV)、棉鈴蟲蛾(Helicoverpa armigera)(棉花螟蛉)核多角體病毒(NPV)、甜菜夜蛾(甜菜菜蛾) mNPV、草地夜蛾(秋季夜盜蛾) mNPV、灰翅夜蛾(Spodoptera littoralis) (非洲棉花葉蟲) NPV。

【0152】 亦包括者為細菌及真菌，其係以'接種菌'加至植物或植物部分或植物器官，且由於其等之特殊性質而促進植物生長及植物健康。實例包括：

土壤桿菌、莖瘤固氮根瘤菌(Azorhizobium caulinodans)、固氮螺旋菌、自生固氮菌(Azotobacter spp.)、慢生根瘤菌、伯克氏菌(Burkholderia spp.)，尤其洋蔥伯克霍爾德菌(Burkholderia cepacia) (以前稱為洋蔥假單胞菌)、巨孢囊黴，或巨大巨孢囊黴(Gigaspora monosporum)、球囊黴、蠟蘑、布氏乳桿菌(Lactobacillus buchneri)、類球囊黴(Paraglomus spp.)、彩色豆馬勃(Pisolithus tinctorus)、假單孢菌(Pseudomonas spp.)、根瘤菌(Rhizobium spp.)，尤其三葉草根瘤菌(Rhizobium trifolii)、根須

腹菌(Rhizopogon spp.)、硬皮馬勃菌(Scleroderma spp.)、黏蓋牛肝菌(Suillus spp.)、鏈球菌(Streptomyces spp.)。

安全劑作為混合組份

【0153】 式(I)化合物可與安全劑，例如解草酮(benoxacor)、喹氧乙酸-米基(quintocet) (-mexyl))、解草胺腈(cyometrinil)、環丙磺醯胺(cyprosulfamide)、二氯丙烯胺(dichlormid)、解草唑(fenchlorazole) (-乙基)、解草啶(fenclorim)、解草安(flurazole)、氟草肟(fluxofenim)、解草噁唑(furilazole)、依殺芬(isoxadifen) (-乙基)、吡唑解草酸(mefenpyr) (-二乙基)、萘二甲酸酐(naphthalic anhydride)、解草腈(oxabetrinil)、2-甲氧基-N-({4-[(甲基胺基甲醯)胺基]苯基}磺醯)苯甲醯胺(CAS 129531-12-0)、4-(二氯乙醯)-1-氧雜-4-氮雜螺[4.5]癸烷(CAS 71526-07-3)、2,2,5-三甲基-3-(二氯乙醯)-1,3-噁唑烷(CAS 52836-31-4)合併。

植物與植物之部分

【0154】 根據本發明可處理所有的植物及植物部分。應瞭解於本文中植物係指所有的植物及植物群，如想要的及不想要的野生植物或作物植物(包括天然作物植物)，例如穀物(如小麥、稻米、黑小麥、大麥、黑麥、燕麥)、玉蜀黍、大豆、馬鈴薯、糖用甜菜、甘蔗、蕃茄、豌豆及其他蔬菜品種、棉花、煙草、歐洲油菜，以及果實植物(含蘋果、梨、柑橘類水果及葡萄之果實)。作物植物可為藉由習用育種及最優化方法或藉由生物技術及基因工程方法或此等方法之組合所得到之植物，包括基因轉殖植物及包括可被植物培育者權利保護或非保護之植物品種。應瞭解植物部份意指該植物所有地上及地上之部分及器官，如芽、葉、花及根，給定之實例為葉，針葉、莖、幹、花、果實體、果實及種子，以及塊莖、根及塊根。植物部分亦包括收成物質及生長性與生殖性繁殖物質，例如插枝、塊莖、根莖、接枝及種子。

【0155】 植物及植物部分用本發明之式(I)化合物處理係直接或藉習用處理方法，例如藉浸泡、噴灑、蒸薰、噴霧、散播、塗抹、注射於允許作用之其產地，棲息地或儲存區域上，於繁殖物質之情況中，特別於種子之情況中亦可藉由施用一種或多種塗層。

【0156】 如上面已提及者，可根據本發明處理所有的植物及其部分。於較佳之具體例中，係處理野生植物種及植物品種，或那些藉由習用生物育種，如雜交或原生質體融合所得到者，及其部分。於進一步較佳之具體例中，係處理基因轉殖植物及藉由基因工程方法，如果適當與習用方法(基因改造生物)合併所得到之植物品種，及其部分。「部分」、「植物的部分」及「植物部分」各詞業已解釋於前。特別佳，根據本發明係處理各個市售習用品種或那些使用中之植物。應瞭解植物品種意指具有新特性(「特點」)且其業已藉由習用育種、藉由誘變或藉由重組DNA技術而獲得之植物。彼等可為栽培種、變種、生物型或基因型。

基因轉殖植物、種子處理及整合事件

【0157】 根據本發明處理之較佳基因轉殖植物或植物品種(那些藉由基因工程所獲得者)係包括所有經由基因改造，接受了授予至此等植物特別有利有用特點之基因物質的植物。此等特性之實例係植物生長更好、提高對高或低溫之耐受性、提高對乾旱或對水分或土壤鹽分之耐受性、提高開花表現、更易收成、加速成熟、產量更高、收穫產物之品質更高及/或營養價值更高、收成產品之保存期限及/或加工性更好。此等特性另外且特別強調之實例係增加該植物對抗動物及微生物害蟲，如對抗昆蟲、蜘蛛、線蟲、蟎蟲、蛞蝓及蝸牛之抗性，其係由於例如，於植物中形成毒性，特別是那些於植物中由蘇雲金芽孢桿菌之基因物質所形成者(例如藉由基因CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c Cry2Ab、Cry3Bb 及CryIF 以及其組合物)，以及提高例如，由系統獲得性抗性(SAR)、系統蛋白(systemin)、植物抗毒素(phytoallexin)、激發子(elicitor)及抗藥性基因及對應表達之蛋白質及毒素所引起該植物對抗植物致病性真

菌、細菌及/或病毒之抗性，以及提高該植物對特定活性除草組成份，例如咪唑啉酮、磺醯脲、草甘膦(glyphosate)或膦塞辛(phosphinothricin)(例如「PAT」基因)之耐受性。於基因轉殖植物中，賦予所討論之想要特點的基因，亦可與另一種組合而存在。基因轉殖植物之實例包括重要的作物植物，如穀物(小麥、稻米、黑小麥、大麥、裸麥、燕麥)、玉蜀黍、大豆、馬鈴薯、糖用甜菜、甘蔗、蕃茄、豆類及其他類型之蔬菜、棉花、煙草、歐洲油菜以及果實植物(含蘋果、梨、柑橘類水果及葡萄之果實)，特別強調者為玉蜀黍、大豆、小麥、稻米、馬鈴薯、棉花、甘蔗、煙草及歐洲油菜。特別強調的特點是提高該植物對昆蟲、蜘蛛、線蟲及蛞蝓及蝸牛之抗性。

作物保護-處理之類型

【0158】 用式(I)化合物處理植物及植物部分係直接或藉習用處理方法，例如藉由浸泡、噴灑、噴霧、灌溉、蒸發、撒粉、成霧、散播、成泡、塗抹、撒佈、注射、灑水(淋透)、滴灌作用於其等之環境、棲息地或儲存區域上，且於繁殖物質之情況中，尤其於種子之情況時，亦藉由乾性種子處理、濕性種子處理、漿液處理、形成外皮、用一種或多種塗層包埋等進行。其亦可藉由超-低容積法施用式(I)化合物或注射使用形式或該式(I)化合物本身至土壤中。

【0159】 植物較佳之直接處理為葉面施用，意指該式(I)化合物係施用至枝葉，其中，處理頻率與施用率應根據所討論之害蟲的侵擾程度來調節。

【0160】 於系統性活性化合物之情況中，該式(I)化合物亦可經由根系到達該植物。然後藉由該式(I)化合物作用於植物之產地而處理該植物。這可例如藉由淋透，或藉由混合於土壤或營養液中來完成，意指用液體形式之該式(I)化合物灌注於該植物之確切地點(例如土壤或水耕系統)，或藉由土壤施用，意指將該式(I)化合物以固態形式(例如以顆粒形式)導入該植物之確切地點中。於水稻作物之情況中，此亦可藉由以固態使用形式(例如以顆粒)計量該式(I)化合物進入淹浸之水稻田中而完成。

種子處理

【0161】 藉由處理植物之種子來控制動物害蟲業已知之甚久且為持續改進之主題。然而，種子之處理經常產生一系列的問題，其總是不能以令人滿意的方式解決。因此，期望發展用來保護種子及發芽中之植物的方法，其可於存儲過程中、於種植後或於該植物出苗後，免除或至少顯著地減少額外配施用農藥。亦另外期望優化所使用之活性組成份的數量，以便對該種子及發芽中之植物提供最好的保護以免被動物害蟲侵害，但不會被所使用之活性組成份損害植物本身。特別，用於處理種子之方法亦應考慮害蟲-抗性或害蟲-耐受性基因轉殖植物固有之殺昆蟲或殺線蟲特性，以便以最低支出之作物保護產品達到最佳保護種子與發芽中之植物。

【0162】 因此，本發明亦更特別關於用於保護種子及發芽中之植物免受害蟲攻擊之方法，其係用一種式(I)化合物處理該種子。本發明用於保護種子及發芽中之植物對抗被害蟲攻擊之方法，進一步包括其中將該種子以一次操作或順序地用式(I)化合物與混合組份同時處理之方法。其亦包括，其中該種子係用式(I)化合物與混合組份於不同的時間點處理之方法。

【0163】 本發明同樣關於式(I)化合物用於處理種子為了保護該種子及所產生之植物防止動物害蟲之用途。

【0164】 本發明進一步關於業已用式(I)化合物處理用於保護防止動物害蟲之種子。本發明亦關於業已用式(I)化合物與混合組份同時處理之種子。本發明進一步關於業已用式(I)化合物與混合組份於不同之時間點處理之種子。於種子業已於不同時間點用式(I)化合物與混合組份處理之情況中，各物質可於該種子上不同之各層中存在。於此情況中，包含式(I)化合物及混合組份之各層可任意被中間層所分離。本發明亦關於種子，其中式(I)化合物與混合組份業已施用作為塗層之一部分或作為附加層或除塗層外之附加層。

【0165】 本發明進一步關於將經由式(I)化合物處理後之種子進行薄膜包埋之過程，以防止粉塵磨損該種子。

【0166】 當一種式(I)化合物系統性作用時發生之一項有利為，處理該種子不僅保護該種子本身，而且保護由該種子發芽後所產生之植物免受動物害蟲。以此方式，可以省略於播種時或於播種後立即處理該作物。

【0167】 另外的優點是用式(I)化合物處理該種子可增進所處理之種子之發芽與出芽。

【0168】 同樣被認為有利的是，式(I)化合物亦可特別用於基因轉殖之種子。

【0169】 式(I)化合物亦可與發送信號技術組成物合併使用，其將導致，例如，與共生菌，例如根瘤菌、菌根菌及/或內生性細菌或真菌較佳之定殖作用及/或優化氮固定。

【0170】 該式(I)化合物係適合於保護於農業、於溫室、於林業或於園藝上使用之任何植物品種之種子。更特別地，此係包括穀物(例如小麥、大麥、裸麥、粟及燕麥)、玉米、棉花、大豆、稻米、馬鈴薯、向日葵、咖啡、煙草、油菜籽、歐洲油菜、甜菜(例如糖用甜菜及飼料甜菜)、花生、蔬菜(例如蕃茄、黃瓜、豆、十字花科蔬菜、洋蔥及萵苣)、果實植物、草坪及觀賞植物之種子。特別重要的是處理穀物(如小麥、大麥、裸麥及燕麥)、玉蜀黍、大豆、棉花、油菜籽、歐洲油菜及稻米之種子。

【0171】 如上面已提到者，基因轉殖種子用式(I)化合物處理亦特別重要。此係涉及植物的種子其通常含有至少一種異種基因控制具有特別殺昆蟲及/或殺線蟲特性之多肽表現。於基因轉殖種子中之異種基因可源自於微生物，如芽胞桿菌屬、根菌瘤、假單孢桿菌、賽氏桿菌屬(Serratia)、木黴屬、棒狀桿菌屬(Clavibacter)、球囊黴屬或膠枝菌屬(Gliocladium)。本發明特別適用於處理含有至少一種異種基因源自於枯草桿菌之基因轉殖種子。該異種基因更佳係由蘇雲金芽孢桿菌所導生。

【0172】 於本發明之內文中，該式(I)化合物係施用至種子。該種子較佳係於穩定狀態下處理，其係足夠穩定而於處理之過程中不會發生損傷。一般而言，該種子可於採收與播種間之任何時間處理。通常，

習慣上係使用業已由植物分離且不含硬軸、殼、柄、皮、茸毛或果實之果肉的種子。例如，可使用業已採收，乾淨且乾燥至含水量容許貯藏之種子。或者，亦可使用乾燥後，已經例如用水處理且然後再乾燥，例如優質的種子。

【0173】 於處理種子時，通常必須確保施用至該種子之式(I)化合物及/或其他添加劑之數量係經選擇使得種子之發芽不會受損，且由其等所生成之植物不會損傷。這必須確保，特別於活性化合物之情況中，以特定之施用率其可能表現出植物毒性效應。

【0174】 該式(I)化合物通常係於適當配製物中施用至種子。適當配製物及用於種子處理之方法係已知於精於此方面技藝之人士。

【0175】 式(I)化合物可轉化為習用種子敷料配製物，如溶液、乳濁液、懸浮液、粉末、泡沫、漿料或其他用於種子之包埋組成物，以及 ULV 配製物。

【0176】 此等配製物係用已知方法，藉著將式(I)化合物與習用添加劑，例如習用增充劑及溶劑或稀釋劑、染劑、潤濕劑、分散劑、乳化劑、防沫劑、防腐劑、次級增稠劑、黏劑、激勃素(gibberellins)以及水混合而製備。

【0177】 可存在於種子敷料配製物中根據本發明使用之有用的染料為習用於此等目的上之所有的染料。可使用略溶於水之顏料，及可溶於水之染料。實例包含名為若丹明 B (Rhodamine B)、C.I.顏料紅色 112 及 C.I.溶劑紅色 1 之染劑。

【0178】 可存在於種子敷料配製物中根據本發明使用之有用的潤濕劑為可促進潤濕且其為習用於活性農化組成份配製物之所有的物質。較佳使用烷基萘磺酸酯，如二異丙基或二異丁基萘磺酸酯。

【0179】 可存在於種子敷料配製物中根據本發明使用之有用的分散劑及/或乳化劑為習用於活性農化組成份配製物之所有的非離子性、陰離子性及陽離子性分散劑。較佳使用非離子或陰離子分散劑或非離子或陰離子分散劑之混合物。適當之非離子分散劑包括，尤其，乙烯化氧/丙烯化氧嵌段聚合物、烷基酚聚乙二醇醚及三苯乙烯苯酚聚乙二醇醚，及其磷酸化或硫酸化衍生物。適當之陰離子分散劑為，

尤其，木質磺酸鹽、聚丙烯酸 鹽類及芳基磺酸酯/甲醛縮合物。

【0180】 可存在於種子敷料配製物中根據本發明使用之有用的防沫劑為習用於活性農化組成份配製物之所有的泡沫抑制物質。較佳使用矽酮防沫劑及硬脂酸鎂。

【0181】 可存在於種子敷料配製物中根據本發明使用之有用的防腐劑為可於農化組成物中此等目的上使用之所有的物質。實例包括二氯酚及苄醇半縮甲醛。

【0182】 可存在於種子敷料配製物中根據本發明使用之有用的次級增稠劑為可於農化組成物中此等目的上使用之所有的物質。較佳之實例包括纖維素衍生物、丙烯酸衍生物、黃原膠、改質黏土及細碎的矽石。

【0183】 可存在於種子敷料配製物中根據本發明使用之有用的黏劑為可於種子敷料產品中使用之所有的習用黏合劑。較佳之實例包括聚乙烯基吡咯烷酮，聚醋酸乙烯酯、聚乙烯醇及纖基醋酸鈉(tylose)。

【0184】 可存在於種子敷料配製物中根據本發明使用之有用的激勃素較佳為激勃素 A1、A3 (=赤黴酸)、A4 及 A7；特別佳係使用赤黴酸。激勃素係為已知(參看 R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz-und Schädlingsbekämpfungsmittel" [作物保護組成物及農藥之化學]，第 2 卷、Springer Verlag，1970，401-412 頁)。

【0185】 可根據本發明使用之種子敷料配製物可直接或於事先用水稀釋後使用，用來處理多種不同類型之種子。例如，該濃縮物或由其藉著用水稀釋所得到之製劑可用來拌敷穀物之種子，如小麥、大麥、裸麥、燕麥，及黑小麥，以及玉蜀黍、稻米、歐洲油菜、豌豆、豆、棉花、向日葵、大豆及甜菜之種子，或者各種不同的蔬菜種子。可根據本發明使用之種子敷料配製物，或其稀釋使用形式，亦可用於拌敷基因轉殖植物之種子。

【0186】 於用可根據本發明使用之種子敷料配製物，或由其所製備之使用形式處理種子時，可使用習用於該種子敷料之所有的混合裝置。於種子敷料之方法中，具體地係以分批或連續操作將該種子裝入混合器中，添加特定所需數量之種子敷料配製物，無論以如此或事先

用水稀釋後，且予以混合直到該配製物均勻分佈於該種子上。如果適當，接著進行乾燥操作。

【0187】 可根據本發明使用之種子敷料配製物之施用率可於相對廣大之範圍內變化。其係藉式(I)化合物於該配製物中之特定內容及藉由該種子來指導。式(I)化合物之施用率通常為每公斤種子介於 0.001 與 50 克之間，較佳為每公斤種子介於 0.01 與 15 克之間。

使用於動物健康中

【0188】 於動物健康領域中，亦即於獸醫用藥領域中，根據本發明之活性組成份係作用對抗動物寄生蟲，尤其外寄生蟲，或者於另外的具體例中係對抗內寄生蟲。「內寄生蟲」一詞包括，尤其，蠕蟲類如絛蟲類、線蟲類或吸蟲綱，及原生動物門，如球蟲目。外寄生蟲典型地且較佳為節肢動物，尤其昆蟲類如蒼蠅(咬蠅及舔蠅)、寄生蠅幼蟲、蝨、髮蝨、鳥蝨、跳蚤等；或蜱蟲類如蜱類，例如硬蜱或軟蜱，或蜱類如疥蜱、恙蜱、鳥蜱等，以及水生外寄生蟲，如撓足類。

【0189】 於獸醫用藥領域中，式(I)化合物具有有利的溫血動物毒性係適用於控制於動物飼養及畜牧業牲畜飼養、養殖動物、動物園動物、實驗室動物、實驗動物及家庭馴養的動物中發生之寄生蟲類。彼等係活性對抗該寄生蟲所有或特定之發育階段。

【0190】 農業畜包括，例如哺乳類，如，綿羊、山羊、馬、驢、駱駝、水牛、兔子、馴鹿、黇鹿，且特別是牛與豬；家禽如火雞、鴨、鵝，且特別是雞；魚或甲殼動物，例如於水產養殖中，以及昆蟲類，如蜜蜂。

【0191】 家庭馴養的動物包括，例如哺乳類，如倉鼠、天竺鼠、大老鼠、小老鼠、栗鼠、雪貂，且特別是狗、貓、籠中鳥、爬蟲類、兩棲類及觀賞魚。

【0192】 於較佳之具體例中，該式(I)化合物係投遞至哺乳類。

【0193】 於另一個較佳之具體例中，該式(I)化合物係投遞至鳥類，亦即籠中鳥且特別是家禽。

【0194】 使用式(I)化合物用來控制動物寄生蟲係意欲減少或防止疾病、死亡情況及表現縮減(於肉、牛奶、羊毛、皮革、蛋、蜂蜜等之情況中)，使動物飼養能夠更經濟且更簡單，且達到動物更健康。

【0195】 於關於動物健康之領域中，「控制」或「控制的」各詞意指，於被此等寄生蟲感染之動物中，該式(I)化合物係有效地減少特定寄生蟲之發生率至無害的程度。更具體地，「控制」於本發明之內文中意指該式(I)化合物可殺死多種寄生蟲，抑制其生長，或抑制其增殖。

【0196】 此等寄生蟲包括：

來自於蝨目，例如，血蝨、長顎蝨、人蝨、陰蝨、管蝨；具體實例為：棘顎蝨、長鼻牛蝨、羊長顎蝨(Linognathus ovillus)、牛長顎蝨(Linognathus oviformis)、足長顎蝨(Linognathus pedalis)、窄面顎蝨、驢血蝨(Haematopinus asini macrocephalus)、牛血蝨、豬血蝨、頭蝨、人體蝨、木蝨(Phylloera vastatrix)、恥陰蝨、小藍牛蝨；

來自於嚙毛目及鈍角亞目與絲角亞目，例如，毛鳥蝨(Trimenopon spp.)、雞蝨(Menopon spp.)、巨毛蝨(Trinoton spp.)、牛羽蝨(Bovicola spp.)、毛蝨(Werneckiella spp.)、利肯唑蝨(Lepikentron spp.)、叮咬蝨(Damalina spp.)、犬毛蝨(Trichodectes spp.)、貓蝨；具體實例為：牛毛蝨、綿羊毛蝨、具邊毛蝨、牛叮咬蝨(Damalina bovis)、犬蝨、鏟吻貓蝨(Felicola subrostratus)、山羊毛蝨(Bovicola caprae)、羊利肯唑蝨(Lepikentron ovis)、馬毛蝨(Werneckiella equi)；

來自於雙翅目及長角亞目與短角亞目，例如，伊蚊、按蚊、庫蚊、墨蚊、真蚋、白蛉、羅蛉、庫蠓、斑虻、短蚋、維蚋、瘤虻、黃虻、牛虻、麻虻、虻蟲(Philipomyia spp.)、蜂蝨蠅、家蠅、齒股蠅、螯蠅、角蠅、莫雷利亞蠅(Morellia spp.)、廁蠅、舌蠅、琉璃蠅、綠蠅、金蠅、肉蠅、大麻蠅、鼻蠅、皮蠅、胃蠅、蝨蠅、鹿蝨蠅、蜱蠅、馬鼻蠅、大蚊；具體實例為：埃及伊蚊、白紋伊蚊、帶喙伊蚊、甘比亞按蚊、五斑按蚊、紅頭麗蠅、雨生麻虻(Chrysozona pluvialis)、五帶淡色庫蚊、尖音庫蚊、環喙庫蚊、夏廁蠅、屍食性麻蠅、廐螯蠅、歐洲大蚊、銅綠蠅、絲光綠蠅、爬蚋、巴氏白蛉(Phlebotomus papatasi)、長須白蛉、斑短蚋(Odagmia ornata)、馬維蚋、赤蚋(Boophthora

erythrocephala)、布洛虻(Tabanus bromius)、黑角虻(Tabanus spodopterus)、北美黑虻、蘇第虻(Tabanus sudeticus)、古氏瘤虻(Hybomitra ciurea)、黑尾斑虻、黃緣斑虻、斑麻虻(Haematopota pluvialis)、穀麻虻(Haematopota italica)、秋家蠅、家蠅、紫角蠅(Haematobia irritans irritans)、弱紫角蠅(Haematobia irritans exigua)、海南角蠅(Haematobia stimulans)、紫齒股蠅(Hydrotaea irritans)、白斑齒股蠅、克洛金蠅(Chrysomya chloropyga)、蛆症金蠅、羊狂蠅、牛皮蠅、紋皮蠅、牛蠅(Przhevalskiana silenus)、人膚皮蠅(Dermatobia hominis)、羊蜱蠅、卡皮鹿蝨蠅(Lipoptena capreoli)、鹿蝨蠅(Lipoptena cervi)、斑紋蝨蠅(Hippobosca variegata)、馬蝨蠅(Hippobosca equina)、腸胃蠅、赤尾胃蠅、小無刺胃蠅、喉胃蠅(Gasterophilus nasali)、黑角胃蠅、黑腹胃蠅、蜂蝨蠅(Braula coeca)；

來自於蚤目，例如，蚤(Pulex spp.)、櫛首蚤、潛蚤、客蚤、角葉蚤；具體實例為：狗櫛首蚤、貓櫛首蚤、致癢蚤、穿皮潛蚤、印度客蚤；

來自於異翅目，例如，臭蟲、錐蝽、紅獵蝽、攀錐蝽；

來自於蜚蠊目，例如，東方蜚蠊、美洲大蠊、德國蟑螂(Blattela germanica)及棕帶蟑螂(Supella spp.)(例如棕帶蟑螂(Suppella longipalpa))；

來自於蜱蟎亞綱(蟎目)及後氣孔亞目與中氣孔亞目，例如，隱喙蜱、鈍喙蜱、耳蜱、硬蜱、花蜱、扇頭蜱(牛蜱屬)、革蜱、血蜱、璃眼蜱、皮刺蟎、扇頭蜱(多寄主性蜱之原屬)、禽刺蟎、肺囊原蟲、耳蟎、肺刺蟎、胸孔蟎(Sternostoma spp.)、瓦蟎、蜂盾蟎；具體實例為：波斯銳喙蜱、鴿銳喙蜱、非洲鈍緣蜱、耳壁蝨(Otobius megnini)、微小扇頭蜱(牛蜱屬)、去色扇頭蜱(Rhipicephalus decoloratu)(牛蜱屬)、環扇頭蜱(Rhipicephalus annulatu) (牛蜱屬)、山形扇頭蜱(Rhipicephalus calceratu)(牛蜱屬)、小亞璃眼蜱、埃及璃眼蜱、邊緣璃眼蜱、短暫璃眼蜱(Hyalomma transiens)、外翻扇頭蜱、篦子硬蜱、六角硬蜱、原野硬蜱、多毛硬蜱(Ixodes pilosus)、淺紅硬蜱、肩突硬蜱、全環硬蜱、嗜群血蜱、刻點血蜱、辛納巴血蜱(Haemaphysalis cinnabarina)、鼠耳血蜱、犬血蜱(Haemaphysalis leachi)、長角血蜱、邊緣革蜱、網紋革

蜱、花紋革蜱、白條革蜱(Dermacentor albipictus)、安氏革蜱、變異革蜱、毛利塔尼璃眼蜱(Hyalomma mauritanicum)、血紅扇頭蜱、囊形扇頭蜱、具尾扇頭蜱、兔扇頭蜱(Rhipicephalus capensis)、杜蘭尼扇頭蜱(Rhipicephalus turanicus)、桑貝滋扇頭蜱(Rhipicephalus zambeziensis)、美洲花蜱、彩飾花蜱、海灣花蜱、斑點蜱、卡延花蜱(Amblyomma cajennense)、雞皮刺螨、囊禽刺螨、林禽刺螨、大蜂螨；

來自於輻螨目(前氣門亞目)及粉螨目(無氣門亞目)，例如，蜂盾螨、姬螯螨、禽螯螨、肉螨、生疥螨、蠕螨、恙螨(Trombicula spp.)、聳螨、粉螨、食酪螨、木嗜螨、頸下螨、翼螨、癢螨、足螨、耳癢螨、疥螨、痴螨、疥螨(Knemidocoptes spp.)、雞螨(Cytodites spp.)及雞雛螨；具體實例為：亞氏姬螯螨(Cheyletiella yasguri)、布氏姬螯螨(Cheyletiella blakei)、犬蠕形螨、牛蠕形螨、羊蠕形螨、山羊蠕形螨、馬蠕形螨、綿羊蠕形螨、豬蠕形螨、秋收恙螨、迪沙新恙螨(Neotrombicula desaleri)、西洛新恙螨(Neoschongastia xerothermobia)、紅恙螨(Trombicula akamushi)、犬耳癢螨、貓背肛螨、犬疥螨、牛疥螨、羊疥螨、肌疥螨(Sarcoptes rupicaprae) (=山羊疥螨(S. caprae))、馬疥螨、豬疥螨、羊癢螨、兔癢螨、馬癢螨、牛足螨、綿羊癢螨、疥螨(Pneumonyssoidic mange)、犬鼻疥螨(Pneumonyssoides caninum)、伍氏蜂盾螨(Acarapis woodi)。

來自於撓足亞綱含有管口目，特別，瘡痂魚蝨屬及魚蝨屬；可藉由實例提及且特別佳之物種為薩氏瘡痂魚蝨(Lepeophtheirus salmoni)、細身魚蝨(Caligus elongates)及克氏魚蝨(Caligus clemensi)。

【0197】 通常，本發明之活性組成份當用於處理動物時可直接利用其等。其等較佳以醫藥組成物之形式使用(投遞)，其可包含已知於此方面技藝中製藥可接受之賦形劑及/或助劑。

【0198】 於動物健康及於動物飼養之領域中，該活性組成份係以已知方式投遞(=給藥)，藉由腸內給藥例如以錠劑、膠囊、藥水、浸液、粒劑、糊劑、大丸劑之形式，經由餵食過程與栓劑，藉由非經腸胃給藥例如藉注射(特別，肌肉內、皮下、靜脈內、腹膜內)、植入物，藉由鼻給藥，藉由皮膚給藥，例如以浸漬或浸泡、噴灑、澆注及沾

上、洗滌及撒粉之形式，以及藉助於含有活性組成份之模製物品，如頸圈、耳標、尾標、肢帶、背心、標示裝置等。該活性組成份可配製成洗髮精或作為可施用於氣溶膠或未加壓噴劑，例如泵噴霧及噴霧器噴霧中之適當配製物。,

【0199】 於用於家畜、家禽、家養寵物等之情況中，本發明之活性組成份可以含有 1%至 80%按重量數量之活性組成份之配製物(例如粉劑、可濕性粉劑[「WP」]、乳濁劑、乳化濃縮物[「EC」]、易流動組成物，均相溶液及懸式濃縮物[「SC」])，直接或於稀釋後(例如 100-至 10000-倍稀釋)，或其等可用作為化學浴使用。

【0200】 於使用於動物健康領域之情況中，為了擴大活性譜，本發明之活性組成份可與適當增效劑、驅蟲劑或其他活性組成份，例如殺蟎蟲劑、殺昆蟲劑、驅蠕蟲劑、抗原生動物劑合併使用。於施用於動物健康之情況中，用於本發明式(I)化合物中之有效的混合組份可為來自於群組(In-1)至(In-25)之一種或多種化合物。

(In-1) 乙醯膽鹼酯酶(AChE)抑制劑類，例如胺基甲酸酯，例如阿蘭克(alanycarb)、得滅克(aldicarb)、苯代克(bendiocarb)、免扶克(benfuracarb)、丁卡波辛(butocarboxim)、丁卡波辛(butoxycarboxim)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、加保殺芬(carbosulfan)、加保殺芬克(ethiofencarb)、加保殺芬((fenobucarb)、覆滅蟎(formetanate)、弗噻克(furathiocarb)、異普克(isoprocarb)、滅賜克(methiocarb)、美索乃(methomyl)、美脫克(metolcarb)、歐殺滅(oxamyl)、皮米克(pirimicarb)、普波索(propoxur)、硫敵克(thiodicarb)、噻芬諾(thiofanox)、三雜滅(triazamate)、三滅克(trimethacarb)、XMC 及塞利克(xylylcarb)；用於施用以對抗外寄生蟲之特別佳者為苯代克、加保利、美索乃、蜱蝨威(promacyl)及普波索；或

有機磷酸化物，例如歐殺松(acephate)、氮雜滅塞磷(azamethipho)、保棉磷(azinphos) (-甲基)、-乙基、硫線磷(cadusafo)、氯乙氧磷(chlorethoxyfos)、克芬松(chlorfenvinpho)、氯滅磷(chlormepho)、氯吡磷(chlorpyrifos) (-甲基)、庫馬磷(coumapho)、氰乃松(cyanophos)、地滅通(demeton-S-甲基)、代淨農(diazinon)、二氯松(dichlorvos)/DDVP、

代克脫磷(dicrotopho)、代克脫磷(dimethoate)、二甲凡磷(dimethylvinphos)、二硫松(disulfoton)、EPN、愛殺松(ethion)、滅線磷(ethopropho)、凡弗(famphur)、凡弗(fenamipho)、撲滅松(fenitrothion)、芬松(fenthion)、噻唑磷(fosthiazate)、庚諾磷(heptenopho)、異芬磷(isofenpho)、O-(甲氧基胺基硫基-磷醯)水楊酸異丙酯、異殺松(isoxathion)、馬拉松(malathion)、滅加松(mecarbam)、達馬松(methamidopho)、殺撲磷(methidathion)、滅威磷(mevinpho)、單克磷(monocrotopho)、乃力得(naled)、歐滅松(omethoate)、氧地滅通-甲基(oxydemeton-methyl)、巴拉松(parathion)、巴拉松-甲基、芬達松(phenthoate)、福瑞松(phorate)、福殺隆(phosalone)、福滅(phosmet)、福發滅(phosphamidon)、磷辛(phoxim)、必利磷(pirimiphos)(-甲基)、佈飛磷(profenofo)、普比達磷(propetampho)、普硫磷(prothiofo)、吡克磷(pyraclofo)、必芬松(pyridaphenthion)、奎納磷(quinalpho)、殺弗特(sulfotep)、特布比磷(tebupirimfo)、特滅磷(temepho)、特丁硫磷(terbufo)、四氯威磷(tetrachlorvinpho)、塞滅通(thiometon)、三落磷(triazopho)、三氯松(triclorfon)及凡米多松(Vamidothion)；用於施用以對抗外寄生蟲之特別佳者為氮雜滅塞磷、克芬松、氯吡磷、庫馬磷、賽灰磷(cythioate)、代淨農(diazinon) (地亞衣(dimpylate))、二氯松(dichlorvos) (DDVP)、代克妥磷(dicrotopho)、大滅松(dimethoate)、代殺松(diethion)、凡弗(famphur) (氨磺磷(famophos))、撲滅松(fenitrothion、芬松(fenthion) (MPP)、庚諾磷(heptenopho)、馬拉松(malathion)、乃力得(naled)、福滅(PMP、弗他落磷(phtalofos)) 磷辛(phoxim)、普比達磷(propetampho)、特滅磷(temepho)、四氯烯磷(tetrachlorvinphos (CVMP)及三落松(triclorfon)/美曲磷酯(metrifonate)。

(In-2) GABA-選通之氯道拮抗劑類，例如有機氯類，例如溴塞靈(bromocyclene)、氯丹(chlordane)及安殺番(endosulfan) (α-)、庚氯(heptachlor)、靈丹(lindane)及多殺芬(toxaphene)；用於施用以對抗外寄生蟲之特別佳者為安殺番(α-)及靈丹；或

非普爾斯(fiproles) (苯基吡唑)，例如乙醯普(acetoprole)、乙普落(ethiprole)、芬普尼(fipronil)、哌弗普(pyrafluprole)、吡利普(pyriprole)、

利殺唑(rizazole)；用於施用以對抗外寄生蟲之特別佳者為芬普尼及吡利普；或

芳基異噁唑啉(arylisoxazolines)、芳基吡咯啉、芳基吡咯啶，例如弗拉納(fluralaner) (已知於 WO2009/2024541，實例 11-1；以及來自於 WO2012007426、WO2012042006、WO2012042007、WO2012107533、WO2012120135、WO2012165186、WO2012155676、WO2012017359、WO2012127347、WO2012038851、WO2012120399、WO2012156400、WO2012163959、WO2011161130、WO2011073444、WO2011092287、WO2011075591、WO2011157748、WO 2007/075459、WO 2007/125984、WO 2005/085216、WO 2009/002809 之化合物)、亞弗索納(afoxolaner)(例如於 WO2011149749 中)及結構相關之芳基吡咯啉 (例如，已知於 WO2009/072621、WO 2010020522、WO 2009112275、WO 2009097992、WO 2009072621、JP 2008133273、JP 2007091708)，或芳基吡咯啶(例如於 WO2012004326、WO2012035011、WO2012045700、WO 2010090344、WO 2010043315、WO 2008128711、JP 2008110971 中)，及來自於所謂間二醯胺基團的化合物(例如，已知於 WO2012020483、WO2012020484、WO2012077221、WO2012069366、WO2012175474、WO2011095462、WO2011113756、WO2011093415、WO2005073165 中)；用於施用以對抗外寄生蟲之特別佳者為亞弗索納及弗拉納。

(In-3) 鈉道調製劑類/電壓依賴鈉道阻斷劑類，例如擬除蟲菊酯類，例如氟丙菊酯(acrinathrin)、烯丙菊酯(d-順式-反式、d-反式)、聯苯菊酯(bifenthrin)、生物丙烯菊酯、生物丙烯菊酯S-環戊烯基、bioresmethrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、塞扶寧(β-)、氯氟氰菊酯(γ-、λ-)、氯氰菊酯(α-、β-、θ-、ζ-)、苯氰菊酯(cyphenothrin) [(1R)-反式異構體]、達滅寧(deltamethrin)、四氟甲醚菊酯(dimefluthrin)、右旋烯炔菊酯(empenthrin) [(EZ)-(1R)異構體]、高氰戊菊酯(esfenvalerate)、醚菊酯(etofenprox)、甲氰菊酯(fenpropathrin)、氰戊菊酯(fenvalerate)、氟氰戊菊酯(flucythrinate)、扶滅寧(flumethrin)、氟胺氰菊酯(τ-)、苄螨醚(halfenprox)、炔咪菊酯(imiprothrin)、甲氧苄氟菊酯(metofluthrin)、氯

氰菊酯、苯醚菊酯(phenothrin) [(1R)-反式異構體]、丙炔菊酯(prallethrin)、丙氟菊酯(profluthrin)、除蟲菊精(pyrethrins)(除蟲菊)、苄呋菊酯(resmethrin)、RU 15525、氟矽菊酯(silafluofen)、胺菊酯(tefluthrin)、似蟲菊[(1R)異構體)]、四溴菊酯(tralomethrin)、四氟苯菊酯(transfluthrin)及 ZXI 8901；用於施用以對抗外寄生蟲之特別佳者為 I 型擬除蟲菊酯類丙烯菊酯、生物丙烯菊酯、氯氰菊酯、苯醚菊酯、苄呋菊酯、似蟲菊及 II 型擬除蟲菊酯類(α氰基擬除蟲菊酯類)α-氯氰菊酯、塞扶寧(β-)、氯氟氰菊酯(λ-)、氯氰菊酯(α-、ζ-)、溴氰菊酯(deltamethrin)、氰戊菊酯、氟氰戊菊酯(flucythrinate)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、氟胺氰菊酯(τ-)，及 the 不含酯之擬除蟲菊酯類，醚菊酯及氟矽菊酯；或有機氯化合物，例如 DDT 或甲氧氯。來自於此類之活性組成份非常特別適當作為混合組份，因為彼等具有更持久之接觸排斥作用且因此延伸活性譜至包括 該組份。

(In-4) 菸鹼乙醯膽鹼受體激動劑類，例如新菸鹼類(neonicotinoids)，例如啶蟲脒(acetamiprid)、噻蟲胺(clothianidin)、呋蟲胺(dinotefuran)、益達胺(imidacloprid)、米達氯辛(imidaclothin)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、噻蟲啉(thiacloprid)、塞速安(thiamethoxam)；用於施用以對抗外寄生蟲之特別佳者為噻蟲胺、呋蟲胺、益達胺、烯啶蟲胺及噻蟲啉；或菸鹼。

(In-5) 變構乙醯膽鹼受體調節劑(激動劑)，例如賜諾殺類(spinosyns)，例如賜諾特(spinetoram)及多殺菌素(spinosad)；用於施用以對抗外寄生蟲之特別佳者為多殺菌素及賜諾特。

(In-6) 氯道活化劑類，例如奧佛麥菌素(avermectins)/米爾倍黴素(milbemycins)，例如阿維菌素(abamectin)、多拉菌素(doramectin)、埃瑪菌素(emamectin)苯甲酸酯、依普菌素(eprinomectin)、伊維菌素(ivermectin)、拉第達汀(latidectin)、雷皮菌素(lepimectin)、米倍黴素肟(milbemycin oxime)、密滅汀(milbemectin)、莫西菌素(moxidectin)及塞拉菌素(selamectin)；吲哚菇類，例如諾杜利酸(nodulisporic acid)衍生物，尤其諾杜利酸 A；用於施用以對抗外寄生蟲之特別佳者為多拉菌素、依普菌素、伊維菌素、米倍黴素肟、莫西菌素、塞拉菌素及諾杜利酸 A。

(In-7) 幼稚型荷爾蒙類似物，例如烯蟲乙酯(hydroprene) (S-)、烯蟲炔酯(kinoprene)、甲氧普烯(methoprene)(S-)；或苯氧威(fenoxycarb)；吡丙醚(pyriproxyfen)；用於施用對抗外寄生蟲，此處特別佳者為甲氧普烯(S-)及吡丙醚。

(In-8) 蟎蟲生長抑制劑類，例如克芬蟎(clofentezine)、氟蟎嗪(diflovidazin)、噻蟎酮(hexythiazox)、乙蟎唑(etoxazole)；用於施用對抗外寄生蟲之特別佳者為乙蟎唑。

(In-9) Slo-1 及蛛毒素(latrophilin)受體激動劑類，例如環縮肽類，例如安無地殺(emodepside)及其之先質 PF1022A (已知於 EP 382173、化合物 I)；用於施用以對抗外寄生蟲之特別佳者為安無地殺。

(In-10) 氧化性磷酸化作用抑制劑類，ATP 斷離劑，例如丁醚脲(diafenthiuron)。

(In-12) 菸鹼乙醯膽鹼受體拮抗劑類，例如免速達(bensultap)、殺螟丹(cartap) (氫氯化物)、殺蟲環(thiocylam)，及塞殺丹(thiosultap) (鈉)。

(In-13) 甲殼素生物合成抑制劑類，0 型，例如苄醯脲類，例如雙三氟蟲脲(bistrifluron)、定蟲隆(chlorfluazuron)、除蟲脲(diflubenzuron)、氟蟎脲(flucycloxuron)、氟蟲脲(flufenoxuron)、六氟隆(hexaflumuron)、蝨蟎脲(lufenuron)、諾伐隆(novaluron)、諾福隆(noviflumuron)、得福隆(teflubenzuron)及殺蟲隆(triflumuron)；用於施用以對抗外寄生蟲之特別佳者為除蟲脲、吡蟲隆、蝨蟎脲及殺蟲隆。

(In-14) 甲殼素生物合成抑制劑類，1 型，例如噻嗪酮(buprofezin)。

(In-15) 蛻皮抑制劑類，例如滅蠅胺(cyromazine)及環蟲腈(dicyclanil)；用於施用以對抗外寄生蟲之特別佳者為滅蠅胺及環蟲腈。

(In-16) 蛻皮激素激動劑類/斷離劑，例如雙醯肼類(diacylhydrazines)，例如環蟲醯肼(chromafenozide)、氯蟲醯肼(halofenozide)、甲氧蟲醯肼(methoxyfenozide)及蟲醯肼(tebufenozide)。

(In-17) 鞣胺激動劑類，例如三亞蟎(amitraz)、蟎蜱胺(cymiazole)、殺蟲脒(chlordimeform)及得米地曲(demiditraz)；用於施用以對抗外寄生蟲之特別佳者為三亞蟎、蟎蜱胺及得米地曲。

(In-18) 絡合物-III 電子輸送抑制劑類，例如氟蚊腙(hydramethylnon)；滅

蠕醌(acequinocyl)；嘧螨酯(fluacrypyrim)。

(In-19) 絡合物-I電子輸送抑制劑類，例如來自於METI殺蟎蟲劑之群組，例如芬殺蟎(fenazaquin)、唑螨酯(fenpyroximate)、嘧螨醚(pyrimidifen)、速蟎酮(pyridaben)、吡螨胺(tebufenpyrad)、唑蟲醯胺(tolfenpyrad)；用於施用以對抗外寄生蟲之特別佳者為唑螨酯、嘧螨醚及唑蟲醯胺；

(In-20) 電壓-選通之鈉道阻斷劑類，例如茚蟲威(indoxacarb)及氰氟蟲腙(metaflumizone)；用於施用以對抗外寄生蟲之特別佳者為茚蟲威及氰氟蟲腙。

(In-21) 乙醯-CoA 羧基酶抑制劑類，例如季酮酸衍生物，例如螺螨酯(spirodiclofen)及螺甲螨酯(spiromesifen)；或二酮(tetramic acid)衍生物，例如螺甲螨酯。

(In-22) 絡合物-II 電子輸送抑制劑類，例如腈吡螨酯(cyenopyrafen)。

(In-23) 羅納丹(ryanodine)受體作用子，例如二醯胺類，例如氟蟲雙醯胺(flubendiamide)、氯蟲苯甲醯胺(chlorantraniliprole)（氯蟲醯胺(Rynaxypyr))、氰蟲醯胺(cyantraniliprole) (Cyazypyr)以及 3-溴-N-{2-溴-4-氯-6-[(1-環丙基乙基)胺基甲醯]苯基}-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-甲醯胺(已知於 WO2005/077934)或 2-[3,5-二溴-2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡唑-5-基]羰基}胺基)苯甲醯基]-1,2-二甲肼羧酸甲酯(已知於 WO2007/043677)。

(In-24) 具有未知作用機制之其他活性組成份，例如印苦楝子素(azadirachtin)、磺胺蟎酯(amidoflumet)、苯肼酸化物((benzoximate)、聯苯肼酯(bifenazate)、蟎離丹(chinomethionat)、冰晶石、丁氟蟎酯(cyflumetofen)、大克蟎(dicofol)、弗殺松(fluensulfone) (5-氯-2-[(3,4,4-三氟丁-3-烯-1-基)磺醯]-1,3-噻唑)、嘧蟲胺(flufenerim)、啶蟲丙醚(pyridalyl)及派弗喹松(pyrifluquinazon)；及另外以堅強芽孢桿菌(Bacillus firmus)為主之製劑(I-1582，BioNeem，Votivo)及下列之已知活性化合物：4-{[(6-溴吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(已知於 WO 2007/115644)、4-{[(6-氟吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(已知於 WO 2007/115644)、4-{[(2-氯-1,3-噻唑-5-基)甲基](2-氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(已知於 WO 2007/115644)、

4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(已知於 WO 2007/115644)、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(已知於 WO 2007/115644)、4-{[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](甲基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(已知於 WO 2007/115643)、4-{[(5,6-二氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(已知於 WO 2007/115646)、4-{[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](環丙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(已知於 WO 2007/115643)、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](環丙基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(已知於 EP-A-0 539 588)、4-{[(6-氯吡啶-3-基)甲基](甲基)胺基}呋喃-2(5H)-酮(已知於 EP-A-0 539 588)、[(6-氯吡啶-3-基)甲基](甲基)氧撐-λ^4-硫烷亞基胺基氰(已知於 WO 2007/149134)、[1-(6-氯吡啶-3-基)乙基](甲基)氧撐-λ^4-硫烷亞基胺基氰(已知於 WO 2007/149134)、[(6-三氟甲基吡啶-3-基)甲基](甲基)氧撐-λ^4-硫烷亞基胺基氰(已知於 WO 2007/095229)、氟啶蟲胺腈(sulfoxaflor) (同樣已知於 WO 2007/149134)、11-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-12-羥基-1,4-二氧雜-9-氮雜二螺[4.2.4.2]十四-11-烯-10-酮(已知於 WO 2006/089633)、3-(4'-氟-2,4-二甲基聯苯基-3-基)-4-羥基-8-氧雜-1-氮雜螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(已知於 WO 2008/067911)、1-[2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亞磺醯]苯基]-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺(已知於 WO 2006/043635)、[(3S,4aR,12R,12aS,12bS)-3-[(環丙基羰基)氧基]-6,12-二羥基-4,12b-二甲基-11-酮基-9-(吡啶-3-基)- 1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氫-2H,11H-苯並[f]吡喃並[4,3-b]色烯-4-基]甲基環丙烷羧酸酯(已知於 WO 2006/129714)、2-氰基-3-(二氟甲氧基)-N-乙基-苯胺磺醯(已知於 WO 2005/035486)、N-[1-(2,3-二甲基苯基)-2-(3,5-二甲基苯基)乙基]-4,5-二氫-2-噻唑胺(已知於 WO 2008/104503)；盤尼奎諾隆 A (penigequinolone) (已知於 EP 2248422 (化合物 I)及 WO 2009/060015 (化合物號碼 11)。

(In-25) 於殺外寄生蟲藥一起使用之情況中，適當之增效劑此處包括 MGK264 (N-辛基二環庚烯甲醯胺)、胡椒基丁醚(piperonyl butoxide) (PBO)及增效炔醚(verbutin)；此處特別佳者為胡椒基丁醚及 MGK264。

【0201】 除了此等基團，亦可於混合物或合併施用中使用短期驅蟲劑。實例為 DEET (N,N-二乙基-3-甲基苯甲醯胺)、埃卡瑞丁(icaridin) (1-吡啶羧酸)、(1S, 20S)-2-甲基吡啶基-3-環己烯-1-甲醯胺(SS220)、避蟲酮(indalone)(丁基 3,4-二氫-2, 2-二甲基-4-酮基-2H-哌喃-6-羧酸酯)、二氫假荊芥內酯(dihydronepetalactones)、諾卡酮(nootkatone)、IR3535 (3-[正-丁基-N-乙醯]-胺基丙酸乙酯)、2-乙基己烷-1,3-二醇，(1R,2R,5R)-2-(2-羥基丙-2-基)-5-甲基-環己-1-醇、二甲基苯-1,2-二羧酸酯、十二烷酸、十一烷-2-酮、N,N-二乙基-2-苯基乙醯胺及精油或其他植物組成份具有已知驅避作用者，例如冰片、紫珠草萜(callicarpenal)、1,8-桉樹腦(桉油醇)、香芹酚、b-香茅醇、a-胡椒烯、香豆素(或其之合成衍生物，已知於 US20120329832)。埃卡瑞丁、避蟲酮及 IR3535 (3-[正-丁基-N-乙醯]-胺基丙酸乙酯)為用於對抗外寄生蟲之特別佳者。

【0202】 由上述基團(I-1)至(I-25)，較佳係以下列之基團作為混合組份：(In-2)、(In-3)、(In-4)、(In-5)、(In-6)、(In-17)、(In-25)。

【0203】 用於本發明之式(I)化合物作為混合組份之殺昆蟲或殺蟎蟲活性化合物、增效劑或驅蟲劑之特別佳的實例為亞弗索納、丙烯菊酯、三亞蟎、生物丙烯菊酯、噻蟲胺(chlothianidin)、塞扶寧(β-)、氯氟氰菊酯(λ-)、蟎蜱胺(cymiazole)、氯氰菊酯(α-、ζ-)、苯氰菊酯、溴氰菊酯、得米地曲(demiditraz)、呋蟲胺、多拉菌素、依普菌素、醚菊酯、氰戊菊酯、芬普尼(fipronil)、吡蟲隆(fluazuron)、氟氰戊菊酯、氟氯苯菊酯、弗拉納、氟胺氰菊酯(τ-)、埃卡瑞丁、益達胺、伊維菌素、MGK264、米倍黴素肟、莫西菌素、烯啶蟲胺、氯氰菊酯、苯氰菊酯、胡椒基丁醚、吡利普、芣呋菊酯、塞拉菌素、氟矽菊酯、賜諾特、多殺菌素、似蟲菊、噻蟲啉。

媒介物控制

【0204】 該式(I)化合物亦可於媒介物控制中使用。於本發明之內文中，媒介物為節肢動物，尤其昆蟲或蛛形目，其能夠由貯藏處(植物、動物、人類等)傳送病原體，例如，病毒、蠕蟲、單細胞生物及細菌至

宿主。該病原體可機械式(例如由非刺痛蒼蠅之沙眼)傳送至宿主或於注射後(例如由蚊子之瘧疾寄生蟲類)進入宿主。

【0205】 媒介物及疾病或病原體傳播之實例為：

1) 蚊子

-按蚊屬：瘧疾、絲蟲病；

-庫蚊屬：日本腦炎、絲蟲病、其他病毒性疾病、蠕蟲傳播；

-伊蚊屬：黃熱病、登革熱、絲蟲病、其他病毒性疾病；

-蚋科：蠕蟲傳播，特別盤尾絲蟲；

2) 蝨：皮膚感染、流行性斑疹傷寒；

3) 跳蚤：瘟疫、地方性斑疹傷寒；

4) 蒼蠅：昏睡病(錐蟲病)；霍亂、其他細菌性疾病；

5) 蜱蟲：蜱病、流行性斑疹傷寒、立克次體痘、兔熱病、聖路易斯型腦炎、蜱媒腦炎(TBE)、剛果出血熱、包柔氏螺旋體病(borellioses)；

6) 蜱：包柔氏螺旋體病，如都同疏螺旋體(Borrelia duttoni)、蜱媒腦炎、Q 熱(貝納柯克斯體(Coxiella burnetii))、巴貝斯原蟲病(babesioses) (犬巴貝斯蟲病犬(Babesia canis canis))。

【0206】 媒介物之實例於本發明之內文中為昆蟲類，例如蚜蟲、蒼蠅、葉蟬或薊馬，其可傳送植物病毒至植物。能夠傳送植物病毒之其他媒介物為葉蜱、蝨、甲蟲及線蟲類。

【0207】 媒介物之其他實例於本發明之內文中為昆蟲類及蜘蛛類，如蚊子，特別是伊蚊屬、按蚊屬，例如甘比亞按蚊(A. gambiae)、阿拉白按蚊(A. arabiensis)、催命按蚊(A. funestus)、大劣按蚊(A. dirus)(瘧疾)及庫蚊屬、蝨、跳蚤、蒼蠅、蜱類及蜱，其可傳送病原體至動物及/或人類。

【0208】 若該式(I)化合物為破壞抗性者，其亦可控制媒介物。

【0209】 該式(I)化合物係適用於預防疾病及/或由媒介物所傳送之病原體。因此，本發明之另一個方面為式(I)化合物於控制媒介物，例如於農業中、於園藝中、於森林中、於花園中及於休閒設施中，以及於保護物料與存儲產品中之用途。

保護工業材料

【0210】 該式(I)化合物係適合用於保護工業材料對抗昆蟲，例如來自於鞘翅目、膜翅目、等翅目、鱗翅目、嚙蟲目及衣魚目之攻擊或破壞。

【0211】 應瞭解，於本發明之內文中工業材料係指無生命之材料，如較佳為塑料、膠黏劑、漿料、紙張及硬紙板、皮革、木材、加工之木製品及塗料組成物。使用本發明用來保護木材為特別佳。

【0212】 於進一步之具體例中，該式(I)化合物係與至少一種另外的殺昆蟲劑及/或至少一種殺真菌劑一起使用。

【0213】 於進一步之具體例中，該式(I)化合物為立即可用之農藥形式，意指彼等可無需進一步修正而施用至所討論之物料上。適當之其他殺昆蟲劑或殺真菌劑為，特別是那些上面提及者。

【0214】 亦已令人驚奇地發現，該式(I)化合物可用於保護接觸到鹽水或鹼水之物體，尤其是船體、篩、網、建築物、停泊及信號系統，防止結垢。該式(I)化合物同樣可單獨或與其他活性組成份，如防污劑一起使用。

控制衛生領域中之動物害蟲

【0215】 該式(I)化合物係適用於控制衛生領域中之動物害蟲。更具體地，本發明可於家用領域中、於衛生領域中及於保護存儲產品中使用，特別用於控制封閉空間，例如住宅、工廠區、辦公室、車箱中所遇到之昆蟲、蜘蛛及蟎蟲。於控制動物害蟲時，該式(I)化合物係單獨或與其他活性組成份及/或助劑合併使用。彼等較佳於家用殺昆蟲劑產品中使用。該式(I)化合物係有效對抗敏感性與抗藥性物種，且對抗所有的發育階段。

【0216】 此等害蟲包括，例如，來自於蛛形綱，來自於蠍目、蜘蛛目及盲珠目，來自於唇足綱及倍足綱，來自於綱昆蟲綱蜚蠊目，來自於鞘翅目、革翅目、雙翅目、異翅亞目、膜翅目、等翅目、鱗翅目、蝨目、嚙蟲目、跳躍亞目或直翅目、蚤目及衣魚目及來自於軟甲亞

綱等足目之害蟲。

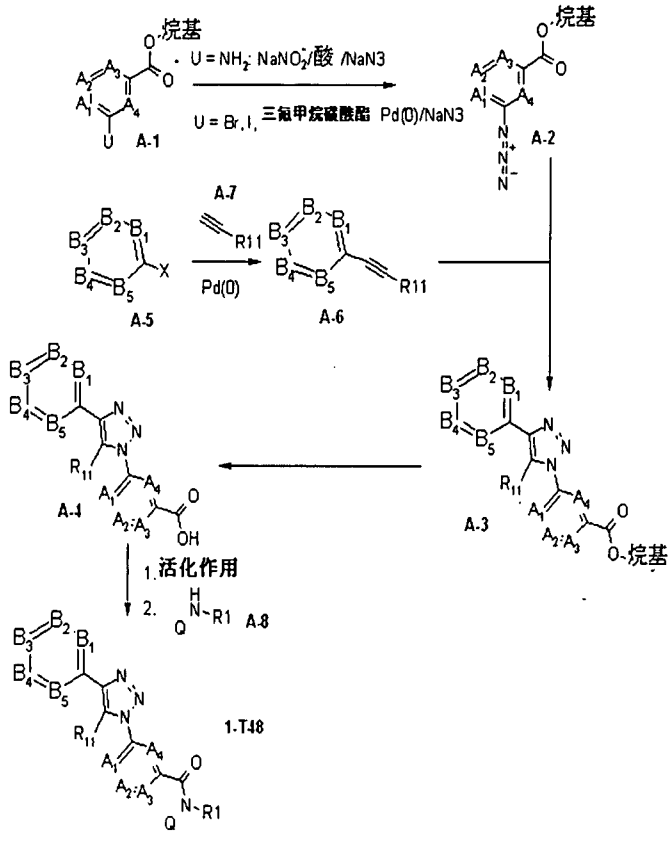
【0217】 施用係於，例如氣溶膠、未加壓噴霧產品例如泵及噴霧器噴霧、自動成霧系統、噴霧器、泡沫、凝膠、蒸發器產品具有由纖維素或塑料所製成之蒸發器標牌、液體蒸發器、凝膠與膜蒸發器、螺旋槳驅動蒸發器、無耗能或被動式蒸發系統、防蛀紙、防蛀袋及防蛀膠中，於誘餌中以顆粒或粉塵用於撒佈或於誘餌站中進行。

製備方法

【0218】 本發明之化合物可藉由精於此方面技藝中之人士已知之習用方法製備。

【0219】 結構**(I-T48)**化合物可藉**反應圖示 1** 中所指定之方法製備。

反應圖示 1

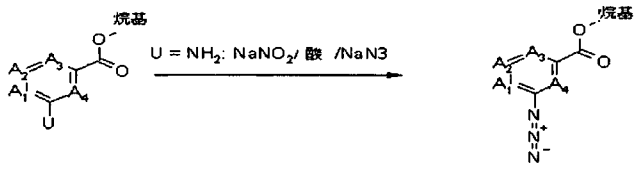


【0220】 該 A_1-A_4、B_1-B_5、烷基、Q、R^1及R^{11}原子團係各自如上所定義者。X 為 Cl、Br、I。U 為胺基、Br、I 或三氟甲烷磺酸酯。

【0221】 結構(**A-1**)起始化合物(例如 EP 1 253 128，8-10 頁)及(**A-5**)係為已知，且其等之中一些係市售可得或可藉文獻中之已知方法製備。

第 1 階段疊氮化物

【0222】 用於製備本發明化合物(I-T48)之方法的第 1 階段：

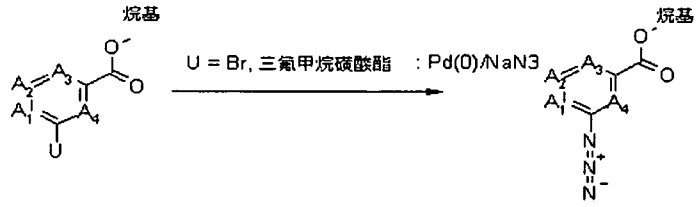


(A-1) (A-2)

【0223】 一般結構(**A-2**)化合物可以類似文獻中之已知方法，由結構(**A-1**)起始物質製備。該 A_1-A_4 及烷基原子團係各自如上所定義者。結構(**A-1**)起始化合物係為已知或可藉由已知的方法製備。實例包括：5-胺基-2-氯苯甲酸甲酯、5-胺基-2-溴苯甲酸乙酯、5-胺基-2-氯-3-氟苯甲酸甲酯、5-胺基-2-氯菸酸乙酯。彼等可，例如，藉由 WO 2011/128251，180 頁；US2010/297073，20 頁；溫馬丁；迪畢斯瓦納；塞朵斯基托馬斯 M.；阿坦巴哈羅伯特 J.；巴沙法蒂瑪 Z.；等，藥物化學期刊，36 (1993)，2676-2688 頁中所說明之方法製備。尚未知之化合物(**A-2**)可以類似由苯胺製備芳基疊氮化物之已知方法製備(C. 格倫德曼於 HoubenWey，第 X/3 卷，801-802 頁，Georg Thieme Verlag Stuttgart 1965 出版))。

【0224】 或者，一般結構(**A-2**)化合物可以類似文獻中之已知方法，由結構(**A-1**)起始物質製備。該 A_1-A_4 及烷基原子團係各自如上所定義者。結構(**A-1**)起始化合物係為已知或可藉由已知的方法製備。實例包括：5-碘-2-氯苯甲酸甲酯、5-溴-2-氯苯甲酸甲酯、5-溴-2-氯-3-氟苯甲酸甲酯、5-碘-2-氯菸酸乙酯。彼等可，例如，藉由 US5250548，實例 208C；溫馬丁；德畢斯瓦納；柴多斯基，托馬斯 M.；歐坦巴，羅伯特 J.；巴沙法蒂瑪 Z.；等，藥物化學期刊，36 (1993)，2676-2688

頁中所說明之方法製備。

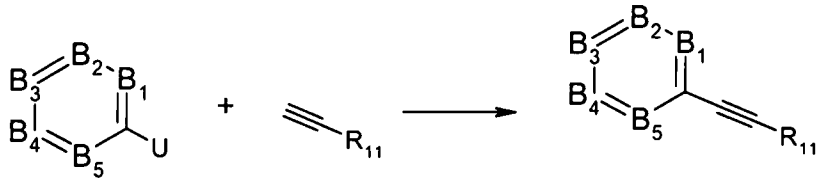


(A-1) (A-2)

【0225】 此外，化合物(**A-2**)可類似文獻中由芳基鹵化物製備芳基疊氮化物之已知方法製備(例如 WO 2010/8831，52 頁)。

階段 2 乙炔

階段 2：製備結構 A6 之起始化合物



(A-5) (A-7) (A-6)

【0226】 一般結構(**A-6**)之本發明化合物係以類似文獻中之已知方法，由結構(**A-7**)起始物質藉由包含鈀及銅之過渡金屬催化劑催化而製備(青吉拉，拉斐爾；納杰拉，卡門，化學學會評論(2011)，40(10)，5084-5121，青吉拉，拉斐爾；納杰拉，卡門，化學評論(華盛頓 DC，美國) (2007)，107(3)，874-922)。

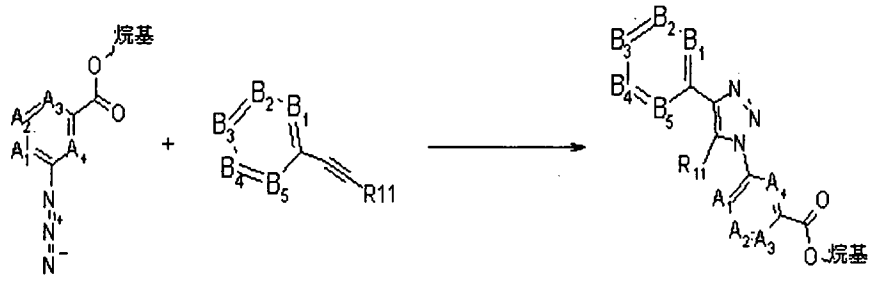
【0227】 該 B_1-B_5、R^6 及 U 原子團係各自如上所定義者。U 為，例如，溴、碘或三氟甲烷磺酸酯。

【0228】 結構(**A-5**)起始化合物係為已知且一些係市售可得或可藉文獻中之已知方法製備或可藉由已知的方法製備。實例包括 2-溴-1,3-二氯-5-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯、2-溴-1,3-二甲基-5-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯、2-溴-1-乙基-3-甲基-5-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯、2-溴-1-氯-5-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]-3-(三氟甲基)苯、2-溴-1-甲基-5-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]-3-(三氟甲基)苯、2-溴-1-氯-5-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]-3-(三氟甲氧基)苯、2-溴-1-甲基-5-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙

基]-3-(三氟甲氧基)苯。彼等可例如，藉由 EP 1 253 128，8-10 頁中所說明的方法製備。

【0229】 結構**(A-7)**起始化合物係為已知或可藉由已知的方法製備。若 R^{11}=H，其可能於該過程中使用保護基而不是 R^{11}。適當的保護基為，例如，三甲基矽烷基、三乙基矽烷基及二甲基羥基甲基。用於引進與分離之其他適當保護基係於文獻[參見，葛林於有機合成保護基中之列表，第 4 版，P. G. M.伍德，T. W. 葛林，約翰威利父子出版公司，Hoboken，新澤西州，2007，927-933 頁]中說明。

階段 3 閉環作用



(A-2) (A-6) (A-3)

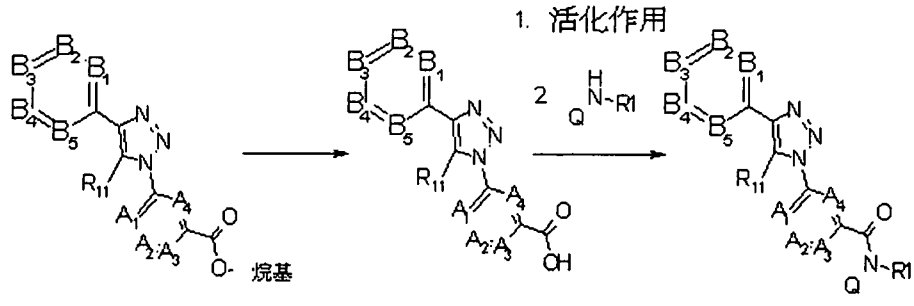
【0230】 一般結構**(A-3)**之本發明化合物係藉結構**(A-2)**疊氮化物與結構**(A-6)**乙炔進行反應而製備。

【0231】 該 A_1-A_4、B_1-B_5、R^{11} 及烷基原子團係各自如上所定義者。

【0232】 結構**(A-2)**及**(A-6)**化合物之製備已說明於前。結構**(A-2)**化合物之實例包括：5-疊氮基-2-氯苯甲酸甲酯、5-疊氮基-2-溴苯甲酸乙酯、5-疊氮基-2-氯-3-氟苯甲酸甲酯、5-疊氮基-2-氯菸酸乙酯。結構(Z6)化合物之實例包括：2-乙炔基-1,3-二氯-5-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯、2-乙炔基-1,3-二甲基-5-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯、2-乙炔基-1-乙基-3-甲基-5-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯、2-乙炔基-1-氯-5-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]-3-(三氟甲基)苯、2-乙炔基-1-甲基-5-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]-3-(三氟甲基)苯、2-乙炔基-1-氯-5-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]-3-(三氟甲氧基)苯、2-乙炔基-1-甲基-5-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]-3-(三氟甲氧基)苯。該反應係於文獻，例如 WO2010008831，52 頁；WO2012175474，118

頁中所說明之條件下進行。

階段 4、5 水解、醯胺化作用

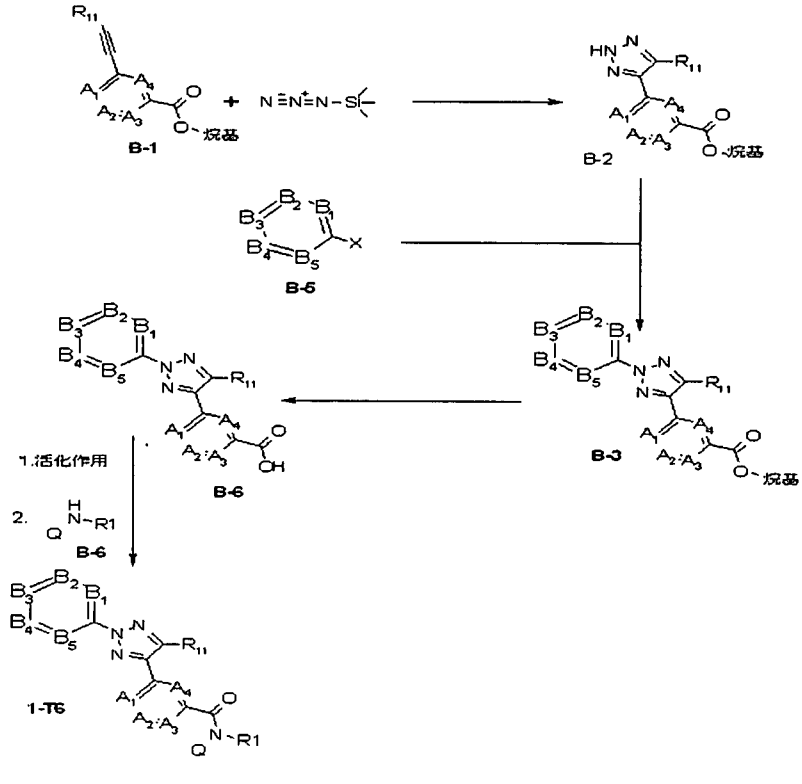


(A-3) (A-4) I-T48

【0233】 一般結構(**I-T48**)之本發明化合物可藉類似文獻中胜肽偶合之已知方法由(**A-4**)及(**A-8**)之起始物質製備[WO2010-051926；WO2010-133312]。一般結構(**A-4**)化合物可類似文獻中之已知方法藉酯水解由一般結構 Z3 之化合物製備[WO2010-051926；WO2010-133312]。該 A_1-A_4、B_1-B_5、烷基、Q、R^1 及 R^{11} 原子團係各自如上所定義者。

【0234】 結構(**I-T6**)化合物可藉反應圖示 2 中所指定之方法製備

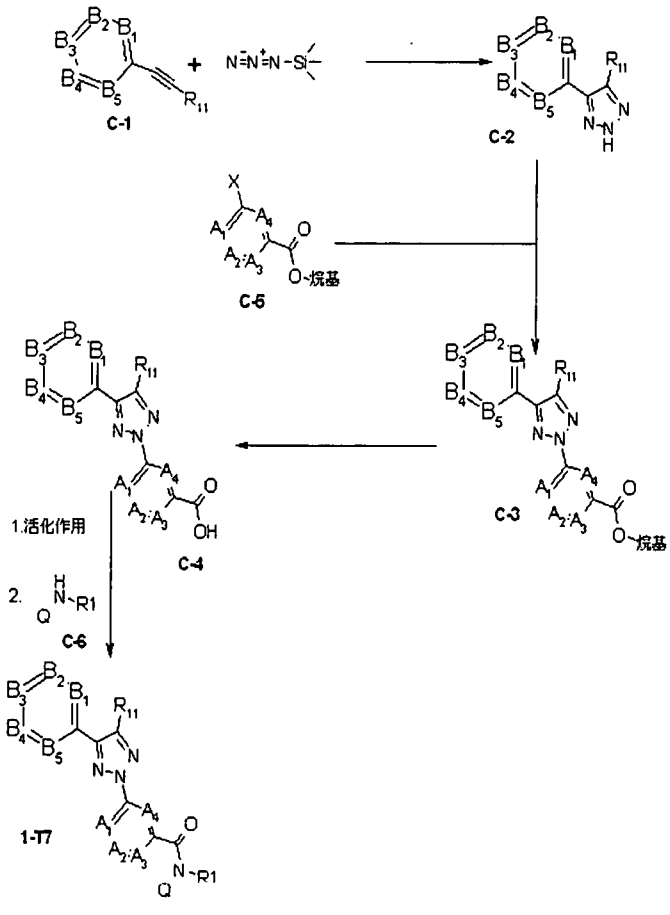
反應圖示 2



【0235】 該 A_1-A_4、B_1-B_5、烷基、Q、R^1及R^{11}原子團係各自如上所定義者。X 為 Cl、Br、I 或三氟甲烷磺酸酯。.結構(**B-1**)及(**B-5**)起始化合物係為已知((**B-1**)，例如，WO 2012/175474，第 117-118 頁；(**B-5**)，例如，US 5,739,083，第 10 頁，US 2003/187233A1，第 6 頁)或可藉由已知的方法製備。一般結構(**B2**)化合物可類似文獻中閉環作用之已知方法由一般結構(**B-1**)化合物製備(例如 WO 2013072825A1，第 40 頁)。一般結構(**B-3**)化合物可類似文獻中偶合之已知方法由一般結構(**B-2**)與一般結構(**B-5**)化合物製備(例如上田聰；蘇明娟；布瓦爾德斯蒂芬 L.，應用化學，國際版，50 (2011) 8944-8947；嚴武明；王橋宜；彼得森杰弗瑞 L.；施曉東；林泉；李明勇，歐洲化學-A 期刊，17 (2011) 5011-5018；)。一般結構(**B-4**)化合物可類似文獻中之已知方法藉酯水解作用由一般結構(**B-3**)化合物製備(WO 2010/051926；WO 2010/133312)。一般結構(**I-T6**)之本發明化合物可類似文獻中胜肽偶合之已知方法由起始物質(**B-4**)及(**B-6**)製備(WO 2010/051926；WO 2010/133312)。

【0236】 結構(**I-T7**)化合物可藉反應圖示 3 中所指定之方法製備

反應圖示 3

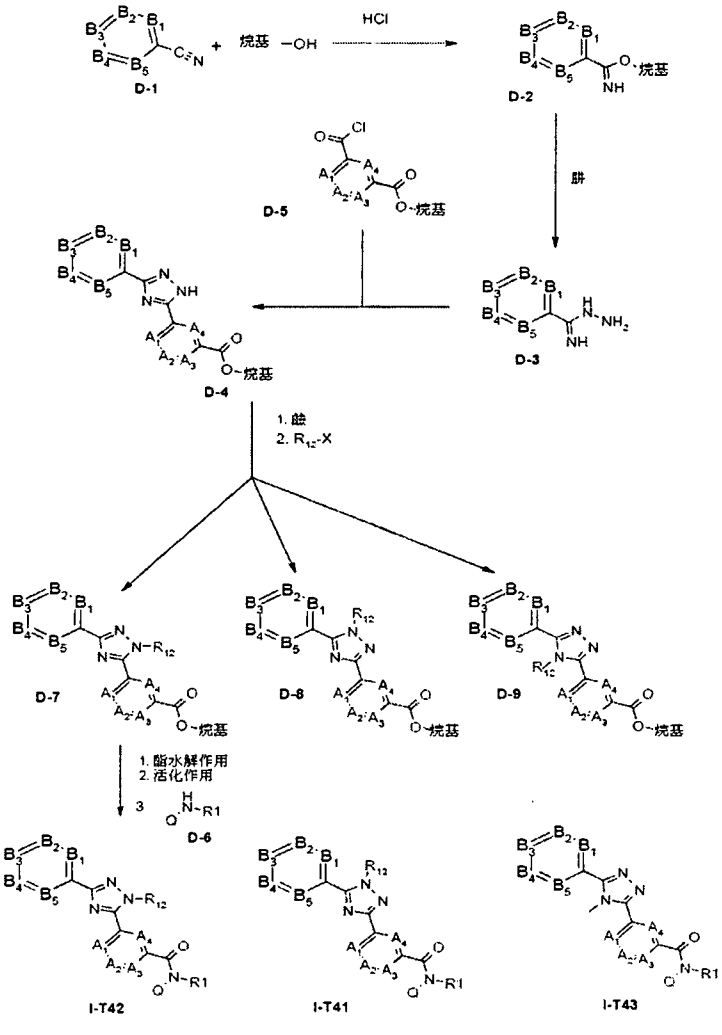


【0237】 該 A_1-A_4、B_1-B_5、烷基、Q、R^1及R^{11}原子團係各自如上所定義者。X 為 Cl、Br、I 或三氟甲烷磺酸酯。一般結構(**C-1**)起始化合物之合成業已說明於前。一般結構(**C-5**)起始化合物係為已知(例如 WO2004/99146，第 68-69 頁)或可藉由已知的方法製備。一般結構(**C-2**)化合物可類似文獻中閉環作用之已知方法由一般結構(**C-1**)化合物製備(例如 WO 2013/072825，40 頁)。一般結構(**C-3**)化合物可類似文獻中偶合之已知方法由一般結構(**C-2**)與一般結構(**C-5**)化合物製備(例如上田聰；蘇明娟；布瓦爾德斯蒂芬 L.，應用化學，國際版，50 (2011) 8944-8947；嚴武明；王橋宜；彼得森杰弗瑞 L.；施曉東；林泉；李明勇，歐洲化學-A 期刊，17 (2011) 5011-5018)。一般結構(**C-4**)化合物可類似文獻中之已知方法藉酯水解作用由一般結構(**C-3**)化合物製備(WO 2010/051926；WO 2010/133312)。一般結構(**I-T7**)之本發明化合物可類似文獻中胜肽偶合之已知方法由起始物質(**C-4**)及(**C-6**)製備(WO 2010/051926；WO 2010/133312)。

【0238】 結構(**I-T41**)、(**I-T42**)及(**I-T43**)化合物可藉反應圖示 4 中所指

定之方法製備。

反應圖示 4

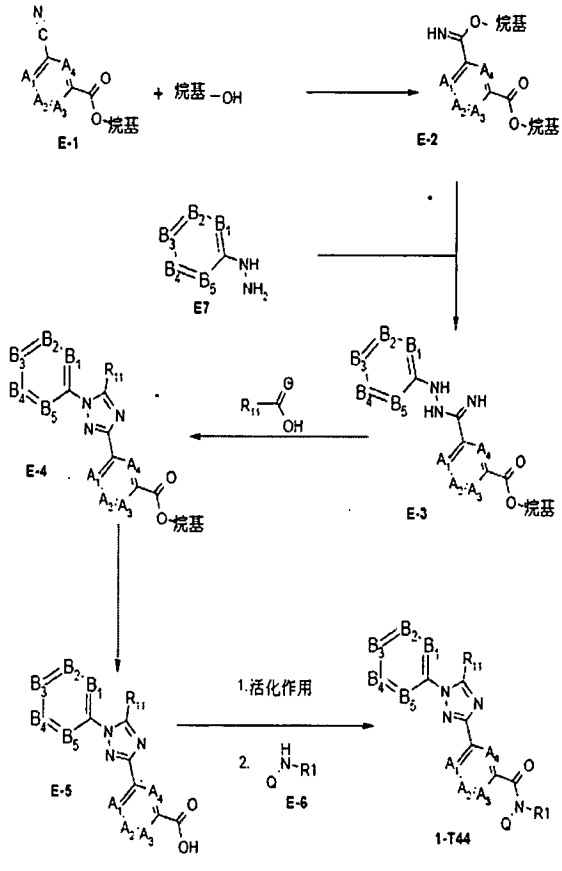


【0239】 該 A_1-A_4、B_1-B_5、烷基、Q、R^1 及 R^{12} 原子團係各自如上所定義者。X 為 Cl、Br、I 或三氟甲烷磺酸酯。結構(**D-1**)及(**D-5**)起始化合物係為已知((**D-1**)，例如，US 2012/0302610，55 頁；(**D-5**)，例如，BE 639732，3 頁)或可藉由已知的方法製備。一般結構(**D-2**)化合物可類似文獻中之已知方法由一般結構(**D-1**)化合物製備(例如 WO 2008/71404，31 頁，實例 5d)。一般結構(**D-4**)化合物可類似文獻中偶合之已知方法，由一般結構(**D-2**)及一般結構(**D-5**)化合物經由中間體(**D-3**)製備。該方法可以一鍋式反應(one-pot reaction)進行(例如 EP 1 405 636，37 頁，實例 36)。一般結構(**D-7**)、(**D-8**)及(**D-9**)化合物可由一般結構(**D-4**)化合物藉烷基化作用而得到。一般結構(**B-4**)化合物可

類似文獻中之已知方法可藉酯水解作用由一般結構(**B-3**)化合物製備(WO 2010/051926；WO 2010/133312)。一般結構(**I-T41**)、(**I-T42**)及(**I-T43**)之本發明化合物可類似文獻中用於酯水解之已知方法(WO 2010/051926；WO 2010/133312)且接著使用文獻中胜肽偶合之已知方法由起始物質(**D-7**)，(**D-8**)及(**D-9**)製備(WO 2010/051926；WO 2010/133312)。

【0240】 結構(**I-T44**)化合物可藉反應圖示 5 中所指定的方法製備。

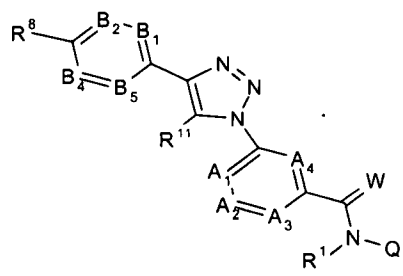
反應圖示 5



【0241】 該 A_1-A_4、B_1-B_5、烷基、Q、R^1及R^{11}原子團係各自如上所定義者。一般結構(**E-1**)起始化合物係為已知(例如 EP 1 719 767，第 41 頁，化合物 73)或可藉由已知的方法製備。一般結構(**E-7**)起始化合物係為已知或可藉由已知的方法製備。實例包括[2,6-二氯-4-(三氟甲基)苯基]肼、[3-氯-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]肼、[2,6-二氯-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基]肼、[2,6-二甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基]肼、[2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]-6-(三氟甲

基)苯基]肼、[2-氯-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]-6-(三氟甲基)苯基]肼。其等可例如，藉由 US2003187233，第 13 頁中所說明之方法製備。一般結構(**E-2**)化合物可類似文獻中之已知方法，由一般結構(**E-1**)化合物(例如 WO 2008/71404，第 31 頁，實例 5d；US 2008/0280869，第 101 頁[0775])製備。一般結構(**E-3**)化合物可類似文獻中之已知方法，由一般結構(**E-2**)及一般結構(**E-7**)化合物(例如 US 2008/0280869，第 101 [0776])製備。一般結構(**E-4**)化合物可類似文獻中閉環作用之已知方法，由化合物(**E-3**)及已知於文獻之羧酸(例如 US 2008/0280869，第 101 頁[0777])製備。一般結構(**E-5**)可類似文獻中用於酯水解之已知方法，由一般結構(**E-4**)化合物(WO 2010/051926；WO 2010/133312)製備。一般結構(**I-T44**)之本發明化合物可類似文獻中胜肽偶合之已知方法，由(**E-5**)及(**E-6**)起始物質(WO 2010/051926；WO 2010/133312)製備。

【0242】 特別佳之具體例係關於式(Id)化合物



(Id)

其中

Q 為環丙基、1-氰基環丙基、氟化之 C_1-C_4-烷基(如 CH_2CF_3)，或噻坦基(如噻坦-3-基)；

R^1 為 H；

R^{11} 為 H；

A^1 及 A^4 各自為 C-H；

A^2 為 C-H 或 N；

A^3 為 C-Cl、C-F、C-I 或 C-Br，較佳 C-Cl；

W 為 O；

R^8 為氟化之 C_1-C_4-烷基，較佳全氟代 C_1-C_4-烷基，如全氟代丙基，更

佳全氟代異丙基(i-C_3F_7)；

B^2及B^4各自為C-H；

B^1為C-(C_1-C_4-烷基)、C-F、C-Cl、C-I或C-Br，較佳C-CH_3或C-Cl；且

B^5為C-(C_1-C_4-烷基)、C-F、C-Cl、C-I或C-Br，較佳C-CH_3或C-Cl。

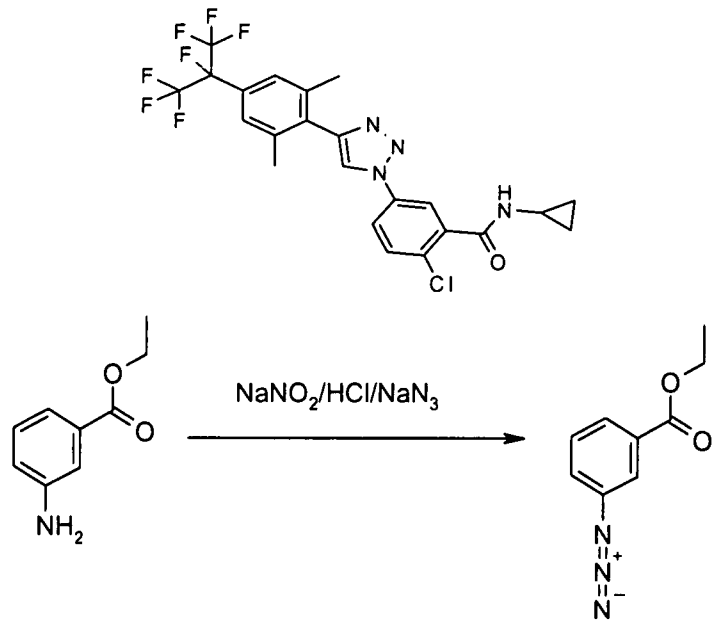
更佳者，B^1及B^5各個為C-(C_1-C_4-烷基)或各個為C-F，或各個為C-Cl，或各個為C-I，或各個為C-Br；最佳係，彼等各個為C-CH_3或各個為C-Cl。

【實施方式】

實驗

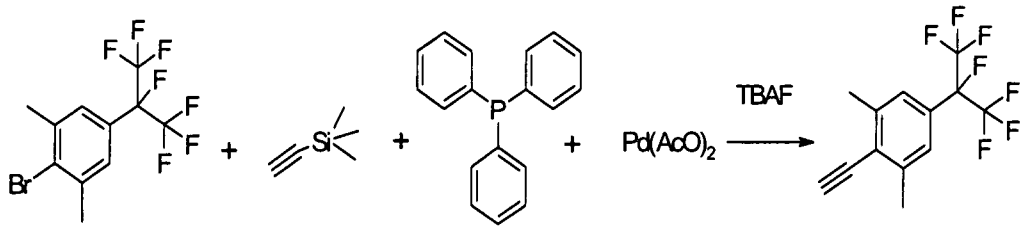
製備方法 I-T48-1

實例 I-T48-1：

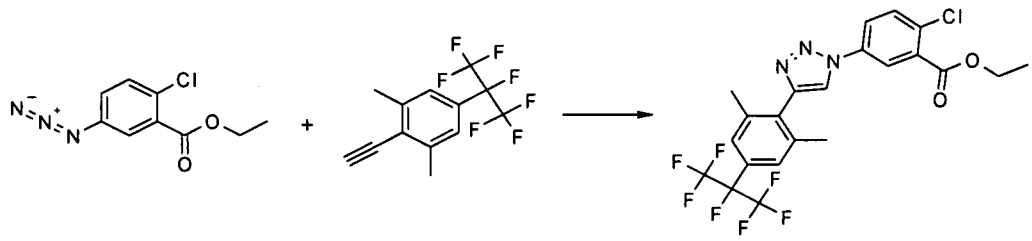


【0243】 將1.46克(7.31毫莫耳) 5-胺基-2-氯苯甲酸乙酯溶解於15毫升丙酮中且冷卻至0°C，且將2.5毫升濃氫氯酸逐滴加入。隨後於0°C，將含有555毫克(8.04毫莫耳)亞硝酸鈉於3毫升H_2O中之溶液逐滴加入。將該混合物於0°C攪拌另外10分鐘，然後於溫度低於5°C時添加含有408毫克(4.97毫莫耳)醋酸鈉於5毫升水中之溶液且然後逐滴加入含有475毫克(7.31毫莫耳)疊氮化鈉於3毫升水中之溶液。然後將該冷卻移除且將該混合物攪拌直到氣體逸出已經結束。於操作

時，將該混合物倒入水中且用醋酸乙酯萃取。將該萃出物用硫酸鈉乾燥且於旋轉蒸發器上於減壓下於浴溫 30°C 濃縮。獲得 2.23 克 5-疊氮基-2-氯苯甲酸乙酯，其中仍含有少許醋酸乙酯。

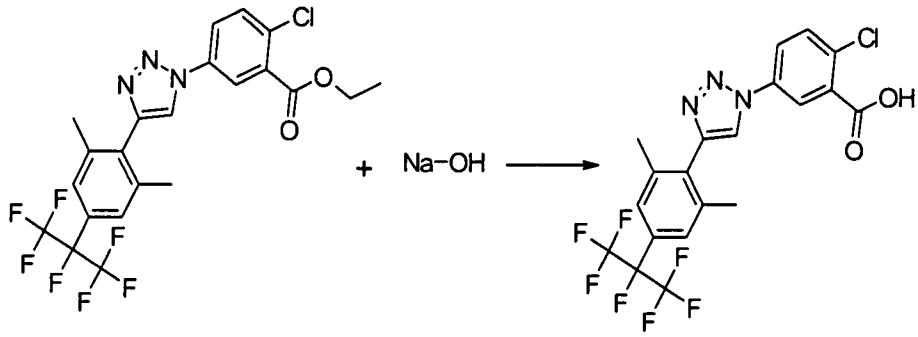


【0244】 將2.3 克(6.51 毫莫耳) 2-溴-1,3-二甲基-5-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟-甲基)乙基]苯與 1.037 克(10.5 毫莫耳)乙炔基三甲基矽烷、35 毫克(0.15 毫莫耳)醋酸鈀(II)及 68 毫克(0.26 毫莫耳)三苯膦於 17 毫升無水三乙胺中合併，且將該混合物於氬氣下加熱至回流過夜。於操作時，將過量三乙胺於減壓下於旋轉蒸發器上於浴溫 30°C 去除，將該殘質與 40 毫升飽和碳酸氫鈉水溶液摻合且將該混合物每次用 24 毫升二氯甲烷予以萃取三次。將合併的萃出物用硫酸鈉予以乾燥且濃縮。將 18 毫升四氫呋喃及 2.3 毫升(2.3 毫莫耳) 1M 四丁基氟化銨於四氫呋喃中之溶液加至該殘質。將該混合物於室溫攪拌達 15 分鐘，然後以空吸法經由矽膠填充之空吸玻料過濾且經由用醋酸乙酯清洗。將該濾出液於減壓下於旋轉蒸發器上於浴溫 30°C 濃縮。然後將該殘質使用 40 克矽膠用 90：10 (v/v)環己烷/醋酸乙酯作為洗提液予以色層分離。獲得 667 毫克 2-乙炔基-1,3-二甲基-5-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯。

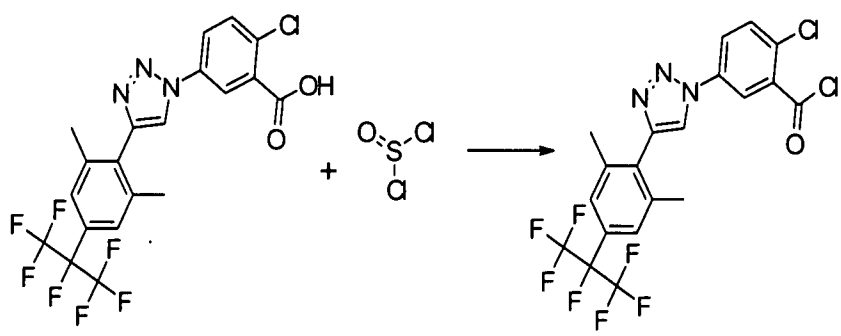


【0245】 將 400 毫克(1.77 毫莫耳) 5-疊氮基-2-氯苯甲酸乙酯起始加入含有 5 毫升水與 5 毫升第三丁醇之混合物中。隨後，將 529 毫克(1.77 毫莫耳) 2-乙炔基-1,3-二甲基-5-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯、105 毫克(0.53 毫莫耳)抗壞血酸鈉溶液及 13 毫克(0.053 毫莫耳)硫酸

銅(II)五水合物加入。將該混合物於室溫攪拌達 3 小時，然後用 10 毫升水稀釋且用二氯甲烷萃取。將該萃出物用硫酸鈉乾燥且將該溶劑於減壓下於旋轉蒸發器上去除。於純化時，將該殘質使用含有 40 克矽膠之匣及溶劑梯度以環己烷/醋酸乙酯 90：10 (v/v)對 70：30 (v/v)予以色層分離。獲得 280 毫克 2-氯-5-[4-[2,6-二甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基]三唑-1-基]苯甲酸乙酯。

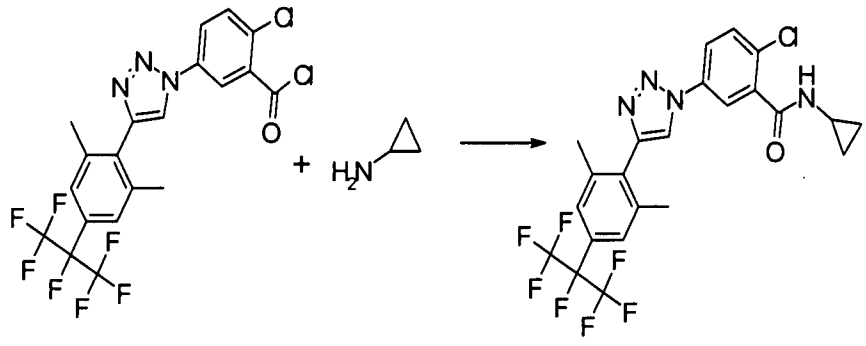


【0246】 將 345 毫克(0.659 毫莫耳) 2-氯-5-[4-[2,6-二甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟-甲基)乙基]苯基]三唑-1-基]苯甲酸甲酯起始加入 35 毫升甲醇中，且加入 0.79 毫升(0.79 毫莫耳) 1M 氫氧化鈉溶液。將該混合物加熱至回流達 3 小時。這之後將該殘質濃縮且分佈於稀氫氯酸與醋酸乙酯之間。將該有機相去除且將含水相用醋酸乙酯萃取二次以上。將該合併的有機相用飽和氯化鈉水溶液清洗，用硫酸鈉乾燥且於旋轉蒸發器上於減壓下濃縮。所得到之殘質為 350 毫克 2-氯-5-[4-[2,6-二甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基]三唑-1-基]苯甲酸。



【0247】 將 350 毫克(0.76 毫莫耳) 2-氯-5-[4-[2,6-二甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟-甲基)乙基]苯基]三唑-1-基]苯甲酸溶解於 4.2 毫升甲苯中，且添加 420 毫克(3.53 毫莫耳)亞硫醯氯。將該反應混合物加熱至回流達 2 小時且然後於減壓下於旋轉蒸發器上濃縮。所得到之殘質為 350

毫克 2-氯-5-[4-[2,6-二甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基]三唑-1-基]苯甲醯基氯化物。



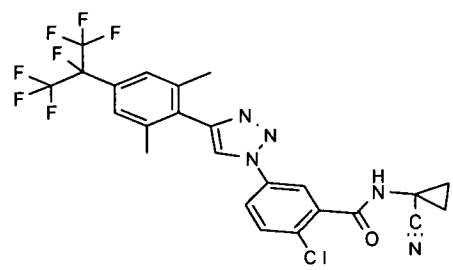
【0248】 將 150 毫克(0.292 毫莫耳) 2-氯-5-[4-[2,6-二甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟-甲基)乙基]苯基]三唑-1-基]苯甲醯基氯化物溶解於 1.5 毫升二氯甲烷中且於 0°C 逐滴加至含有 42 毫克(0.729 毫莫耳)環丙胺於 1.5 毫升二氯甲烷中之溶液。將該反應混合物於室溫攪拌達 2 小時且然後倒入 5% 二氫磷酸鈉水溶液中。將該有機相去除，用飽和氯化鈉水溶液清洗一次，用硫酸鈉乾燥且濃縮。將該殘質藉由色層分離法於 15 克矽膠上用梯度以環己烷/醋酸乙酯 90：10 至 50：50 (v/v) 予以純化。所得到之殘質為 115 毫克 2-氯-N-環丙基-5-[4-[2,6-二甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基]三唑-1-基]苯甲醯胺(化合物 **I-T48-1**)。

HPLC-MS[a)]：logP = 4.19，質量(m/z) = 535 [M+H]+。

^{1}H NMR (400 MHz, d_3-乙腈)：δ = 8.39 (s , 1 H)，7.92-7.95 (m , 2 H)，7.66 (d , J1=8.5 Hz，1H)，7.48 (s , 1 H)，7.07 (s (寬)，1 H (N-H))，2.84-2.87 (m , 1H)，2.25 (s , 6 H)，0.76-0.8 (m , 2 H)，0.61-0.62 (m , 2 H)。

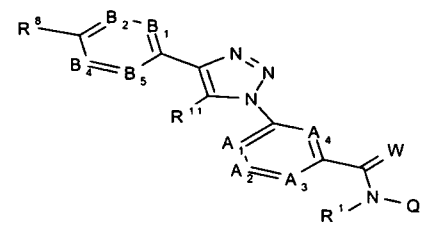
【0249】 下列者係以類似於實例 I-T48-1 之方法製備：

實例 I-T48-2：



HPLC-MS[a)]：logP = 4.10，質量(m/z) = 560 [M+H]+.

^{1}H NMR (400 MHz, d_3-乙腈)：δ = 8.40 (s , 1H)，7.98-8.01 (m , 2 H)，7.80 (s (寬)，1 H (N-H))，7.70 (d , J1=8.7 Hz，1H)，7.48 (s , 1 H)，2.25 (m , 1H)，1.55-1.60 (m , 2 H)，1.35-1.38 (m , 2 H)。



(Id)

B_2 及 B_4 = C-H，W = O

Ex. No.	B_1	R^8	B_5	R_1	R^{11}	A_1	A_2	A_3	A_4	Q	logP[a)]	質量 [m/z] [a)1)]
I-T48-1	C-CH_3	-i-C_3F_7	C-CH_3	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	環丙基	4.19	535
I-T48-2	C-CH_3	-i-C_3F_7	C-CH_3	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	1-氰基-環丙基	4.1	560
I-T48-3	C-Cl	-i-C_3F_7	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	環丙基	4.3	575
I-T48-4	C-Cl	-i-C_3F_7	C-Cl	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	1-氰基-環丙基	4.2	600
I-T48-5	C-CH_3	-i-C_3F_7	C-CH_3	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	CH2CF3	4.5	577
I-T48-6	C-CH_3	-i-C_3F_7	C-CH_3	H	H	C-H	C-H	C-Cl	C-H	噻坦-3-基	4.5	567
I-T48-7	C-CH_3	-i-C_3F_7	C-CH_3	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	環丙基	2.61 分鐘 [b)]	536
I-T48-8	C-CH_3	-i-C_3F_7	C-CH_3	H	H	C-H	N	C-Cl	C-H	1-氰基-環丙基	2.62 分鐘 [b)]	561

[b)] 停滯時間係用：儀器：Micromass Quattro Premier with Waters UPLC Acquity；管柱：Thermo Hypersil GOLD 1.9 μ 50 x 1 毫米；洗提液 A：1 升水+ 0.5 毫升 50%甲酸；洗提液 B：1 升乙腈 + 0.5 毫升 50%甲酸；梯度：0.0 分鐘 97% A → 0.5 分鐘 97% A → 3.2 分鐘 5% A → 4.0 分鐘 5% A；烘箱：50°C；流速：0.3 毫升/分鐘；UV 檢測：210 毫微米測定。

[1)] 所說明之質量係為$[M+H]^+$離子同位素模型最高強度之峰值；若檢測到該$[M-H]^-$離子時，所說明之質量係用[2]來確認。

[2] 所說明之質量係為$[M-H]^-$離子同位素模型最高強度之峰值。

[a)] 特別提到關於 logP 值與質量檢測之測定：該 logP 值係根據 EEC Directive 79/831 Annex V.A8，藉由 HPLC (高效液體色層分析法)於逆相管柱(C18) Agilent 1100 LC 系統上測定；50*4.6 Zorbax Eclipse Plus C18 1.8 微米；洗提液 A：乙腈(0.1% 甲酸)；洗提液 B：水(0.09%甲酸)；線性梯度於 4.25 分鐘內由 10%乙腈至 95%乙腈，然後 95%乙腈另外 1.25 分鐘；烘箱溫度 55°C；流速：2.0 毫升/分鐘。質量檢測係用 Agilent MSD 系統進行。

選擇實例之 NMR 數據

【0250】 選擇實例之 ^{1}H NMR 數據係以 ^{1}H NMR 峰值列表之形式報導。對於每一個信號峰，首先該δ值係以 ppm 計且然後該信號強度係於圓括號中列舉。於不同的信號蜂時，該δ值-信號強度數對，係藉由分號使彼此分離而列舉。

【0251】 因此，於一個實例中該峰值列表具有下列之形式：

【0252】 δ_1 (強度 $_1$)；δ_2 (強度 $_2$)；.....；δ_i (強度 $_i$)；...；δ_n (強度 $_n$)

【0253】 於 NMR 光譜以公分計之公佈實例中，尖銳信號之強度係與信號之高度相互關聯且顯示真正的信號強度關係。於寬信號之情況中，幾個峰或中間信號及其相對強度可與該光譜中最密集之信號相較而顯示。

【0254】 於校準 ^{1}H NMR 光譜之化學位移時，吾等係使用四甲基矽烷及/或該溶劑之化學位移，特別於光譜係於 DMSO 中測定之情況時。因此於 NMR 峰值列表中，四甲基矽烷峰可能會產生，但不一定。

【0255】 該 ^{1}H NMR 峰之列舉係類似於習用 ^{1}H NMR 打印且因此經常含有於習用 NMR 譯碼中所列舉之所有的峰。

【0256】 此外，像習用之 ^{1}H NMR 打印，其等可顯示溶劑之信號，該目標化合物之立體異構體之信號，其同樣形成本發明主題之一部

分，及/或雜質之峰。

【0257】 於化合物信號以溶劑及/或水之δ範圍之報導中，吾等之 1H NMR 峰值列表顯示常用溶劑的峰，例如 DMSO 於 DMSO-D_6 之峰及水之峰，其通常具有高強度平均。

【0258】 該目標化合物之立體異構物之各峰及/或雜質之各峰，比目標化合物之各峰，通常具有平均較低之強度(例如，具有純度>90%)。

【0259】 此等立體異構物及/或雜質可能是該特殊製備方法所特有。其等之各峰可於此情況中，參照「副產品指紋」因而有助於確認複製吾等之製備方法。

【0260】 藉由已知方法(MestreC，ACD 模擬，而且用經驗評估之預期值)計算該目標化合物峰值之專家，如果需要，可任意使用另外的強度濾波器來分離該目標化合物之各峰。該分離係類似於習用 1H NMR 譯碼中選取相關峰。

【0261】 更詳細之 1H NMR 峰值列表說明可於研究揭示內容資料庫編號 564025 中找到。

實例 I-T48-1：^{1}H-NMR (601.6 MHz, CD3CN)： δ = 8.385 (4.8)；7.953 (1.8)；7.949 (3.5)；7.946 (2.6)；7.941 (0.9)；7.931 (2.1)；7.927 (1.5)；7.668 (2.6)；7.654 (2.4)；7.480 (4.8)；7.073 (0.4)；2.873 (0.6)；2.867 (0.8)；2.861 (1.3)；2.855 (1.2)；2.849 (0.8)；2.843 (0.6)；2.259 (1.1)；2.252 (25.5)；2.181 (4.9)；2.178 (5.6)；2.176 (6.0)；2.173 (5.5)；2.169 (5.9)；2.166 (5.2)；1.966 (0.4)；1.958 (1.2)；1.954 (1.4)；1.950 (8.0)；1.946 (14.0)；1.942 (20.3)；1.938 (13.5)；1.934 (6.7)；1.436 (16.0)；0.798 (0.6)；0.789 (1.8)；0.786 (2.4)；0.778 (2.5)；0.774 (1.9)；0.766 (0.8)；0.623 (0.8)；0.615 (1.9)；0.612 (2.0)；0.608 (1.8)；0.605 (1.9)；0.597 (0.6)；0.005 (0.9)；0.000 (29.6)；-0.006 (1.0)
實例 I-T48-2：^{1}H-NMR (601.6 MHz, CD3CN)： δ = 19.952 (0.5)；8.399 (16.0)；8.018 (6.1)；8.014 (8.7)；8.001 (5.2)；7.997 (3.2)；7.987 (5.3)；7.982 (4.1)；7.801 (1.4)；7.706 (8.0)；7.691 (7.2)；7.482 (14.5)；2.359 (0.5)；2.254 (72.9)；2.195 (45.7)；2.188 (56.7)；2.185 (44.6)；2.184 (48.4)；2.181 (81.2)；2.179 (45.4)；2.146 (0.4)；2.053 (0.5)；1.973 (0.6)；1.967 (1.9)；1.959 (5.1)；1.954 (6.1)；1.951 (32.7)；1.946 (56.6)；1.942 (82.3)；1.938 (55.6)；1.934 (28.0)；1.828 (0.5)；1.603 (3.4)；1.594 (8.8)；1.589 (8.7)；1.580 (4.2)；1.553 (0.5)；1.436 (4.8)；1.406 (0.4)；1.379 (4.3)；1.370 (8.5)；1.365 (9.1)；1.356 (3.4)；0.097 (0.4)；0.005 (3.1)；0.000 (96.9)；-0.006 (3.8)；-0.101 (0.3)
實例 I-T48-3：^{1}H-NMR (400.0 MHz, CD3CN)： δ = 8.579 (0.5)；8.565 (10.6)；7.956 (3.8)；7.949 (12.6)；7.928 (4.6)；7.922 (3.1)；7.843 (16.0)；7.687 (0.6)；7.680 (5.0)；7.678 (5.1)；7.658 (4.5)；7.065 (1.5)；5.448

(0.5)；2.890 (0.4)；2.880 (1.2)；2.871 (1.8)；2.862 (2.6)；2.853 (2.7)；2.844 (1.8)；2.835 (1.2)；2.825 (0.4)；2.164 (50.1)；2.114 (0.4)；2.108 (0.4)；1.965 (1.9)；1.959 (4.9)；1.953 (25.6)；1.947 (46.9)；1.941 (63.2)；1.935 (44.3)；1.929 (23.2)；1.769 (0.4)；1.436 (6.1)；1.269 (0.5)；0.806 (1.4)；0.793 (4.4)；0.788 (5.9)；0.775 (6.1)；0.770 (4.5)；0.758 (2.0)；0.630 (1.9)；0.618 (5.3)；0.613 (5.7)；0.609 (5.1)；0.603 (4.8)；0.591 (1.4)；0.146 (0.4)；0.008 (2.9)；0.000 (83.6)；-0.008 (4.3)；-0.150 (0.4)
實例 I-T48-4：^{1}H-NMR (400.0 MHz, CD3CN)： δ = 8.577 (10.6)；8.018 (4.6)；8.011 (7.8)；8.003 (5.0)；7.996 (2.5)；7.982 (4.3)；7.975 (3.3)；7.844 (16.0)；7.770 (1.5)；7.714 (6.3)；7.693 (5.5)；5.448 (3.8)；2.786 (0.4)；2.164 (35.0)；2.109 (0.4)；1.972 (1.1)；1.965 (1.6)；1.959 (4.0)；1.953 (18.9)；1.947 (34.5)；1.941 (46.5)；1.935 (33.9)；1.929 (18.8)；1.607 (2.8)；1.592 (7.7)；1.585 (7.9)；1.572 (4.1)；1.532 (0.5)；1.436 (2.3)；1.426 (0.6)；1.386 (3.9)；1.372 (8.0)；1.365 (8.3)；1.350 (3.1)；1.268 (0.7)；1.221 (0.3)；1.204 (0.5)；0.008 (2.7)；0.000 (55.8)
實例 I-T48-5：^{1}H-NMR (400.0 MHz, CD3CN)： δ = 8.403 (13.3)；8.014 (4.7)；8.013 (4.7)；8.008 (10.2)；8.005 (9.1)；7.982 (4.5)；7.977 (3.7)；7.726 (6.7)；7.705 (5.8)；7.526 (2.1)；7.482 (16.0)；5.449 (3.6)；5.448 (3.7)；4.161 (1.5)；4.144 (2.0)；4.137 (4.8)；4.121 (5.0)；4.114 (5.4)；4.097 (4.7)；4.091 (2.5)；4.074 (1.6)；3.361 (0.9)；2.463 (1.0)；2.460 (0.9)；2.437 (0.7)；2.415 (0.5)；2.257 (68.9)；2.160 (226.0)；2.122 (1.2)；2.115 (1.3)；2.109 (1.5)；2.103 (1.1)；2.097 (1.0)；1.964 (7.3)；1.954 (68.1)；1.953 (72.5)；1.948 (129.1)；1.947 (130.5)；1.942 (179.5)；1.940 (173.6)；1.936 (143.6)；1.930 (84.2)；1.781 (0.5)；1.775 (0.8)；1.769 (1.1)；1.764 (0.9)；1.758 (0.5)；1.438 (0.5)；1.270 (0.7)；0.237 (0.7)；0.147 (1.0)；0.001 (192.8)；0.000 (199.3)；-0.149 (1.1)
實例 I-T48-6：^{1}H-NMR (400.0 MHz, CD3CN)： δ = 8.396 (8.2)；7.997 (3.5)；7.991 (5.1)；7.971 (3.0)；7.965 (1.8)；7.950 (3.2)；7.943 (2.5)；7.696 (4.6)；7.674 (3.9)；7.621 (0.7)；7.481 (7.6)；5.448 (3.3)；5.342 (1.0)；5.320 (2.0)；5.300 (2.0)；5.279 (1.1)；4.086 (1.0)；4.068 (3.0)；4.050 (3.1)；4.032 (1.0)；3.554 (2.8)；3.550 (1.7)；3.530 (5.0)；3.511 (2.0)；3.508 (3.6)；3.379 (3.7)；3.375 (2.2)；3.359 (5.1)；3.355 (4.7)；3.338 (1.5)；3.335 (2.7)；2.463 (0.4)；2.257 (41.9)；2.163 (53.8)；2.114 (0.4)；2.108 (0.5)；2.101 (0.4)；2.095 (0.4)；1.972 (13..7)；1.964 (2.6)；1.958 (5.9)；1.953 (33.4)；1.946 (60.6)；1.940 (81.8)；1.934 (56.5)；1.928 (29.3)；1.775 (0.3)；1.769 (0.5)；1.763 (0.3)；1.437 (16.0)；1.221 (3.7)；1.204 (7.4)；1.186 (3.7)；0.146 (0.5)；0.008 (4.0)；0.000 (121.2)；-0.009 (4.7)；-0.150 (0.5)
實例 I-T48-7：^{1}H NMR (400.1 MHz, d_6-DMSO)： δ = 9.15 (0.1263)；9.14 (0.1329)；9.11 (0.2764)；9.06 (0.0239)；8.81 (0.0568)；8.80 (0.0599)；8.54 (0.1355)；8.53 (0.1358)；7.50 (0.1932)；2.88 (0.0228)；2.87 (0.0370)；2.86 (0.0399)；2.85 (0.0258)；2.84 (0.0210)；2.54 (0.8060)；2.29 (0.0342)；2.27 (0.9003)；0.78 (0.0248)；0.76 (0.0685)；0.76 (0.1051)；0.75 (0.0970)；0.74 (0.0893)；0.73 (0.0376)；0.59 (0.0320)；0.58 (0.0869)；0.58 (0.0960)；0.57 (0.0860)；0.57 (0.0899)；0.55 (0.0315)；0.14 (0.0869)；0.12 (0.2710)；0.01 (0.0294)；0.01 (0.0232)；-0.01 (0.0366)；-0.01 (0.0457)；-0.01 (0.0193)。
實例 I-T48-7：^{1}H-NMR (400.1 MHz, d_6-DMSO)： δ = 9.72 (0.0420)；9.19 (0.0433)；9.18 (0.0454)；9.12 (0.0877)；8.65 (0:0445)；8.65 (0.0452)；7.50 (0.0653)；2.54 (0.8050)；2.27 (0.3018)；1.64 (0.0353)；1.63 (0.0413)；

1.33 (0.0350)；1.33 (0.0419)；0.13 (0.0233)；0.12 (0.0656)；0.01 (0.0310)；0.00 (1.0000)；-0.01 (0.0534)。

生物實例

微小牛蜱-注射試驗(BBOMI Inj)

溶劑： 二甲亞碸

【0262】 為了製造適當之活性組成份配製物，將 10 毫克活性組成份與 0.5 毫升溶劑混合且將該濃縮物用溶劑稀釋至所需之濃度。

【0263】 將 1 微升活性組成份溶液注入至 5 隻吮足血之成年雌性牛蜱(微小牛蜱)腹部。將該等動物轉移至各皿中且保持於氣候控制之房間內。

【0264】 效益係於產下受精卵 7 天後進行評估。將非目視可見之受精蛋存儲於氣候控制之櫃中直到約 42 天後幼蟲孵出。100%之效益意指沒有任何蜱產下受精卵；0%意指所有的蛋為受精者。

【0265】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-T48-2，以 4 微克/動物之施用率施用時展示 100%之效益。

貓櫛首蚤-口服試驗(CTECFE)

溶劑： 二甲亞碸

【0266】 為了製造適當活性組成份配製物之目的，將 10 毫克活性組成份與 0.5 毫升二甲亞碸混合。用檸檬酸化牛血稀釋而得到所需之濃度。

【0267】 將約 20 隻未餵食之成年貓蚤(貓櫛首蚤)放進用紗布封閉頂部與底部之小室中。將底端用封口膜封閉之金屬管柱置於該小室中。該圓筒含有血液/活性組成份製劑，其可由該跳蚤經由封口膜而吸進。

【0268】 於 2 天後，測定以%計之殺死率。100%意指所有的跳蚤已被殺死；0%意指沒有跳蚤被殺死。

【0269】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-T48-2，以 20 ppm 之施用率施用時展示 100%之效益。

S

銅綠蠅試驗(LUCICU)

溶劑： 二甲亞碸

【0270】 為了製造適當之活性組成份配製物，將 10 毫克活性組成份與 0.5 毫升二甲亞碸混合，且將該濃縮物用水稀釋至所需之濃度。

【0271】 將約 20 隻澳大利亞羊綠頭蒼蠅(銅綠蠅)之 L1 幼蟲轉移至含有碎馬肉及所需濃度之活性組成份製劑之試驗容器中。

【0272】 於 2 天後，測定以%計之殺死率。100%意指所有的幼蟲已被殺死；0%意指沒有任何幼蟲被殺死。

【0273】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-T48-2，以 20 ppm 之施用率施用時展示 100%之效益。

家蠅試驗(MUSCDO)

溶劑： 二甲亞碸

【0274】 為了製造適當之活性組成份配製物，將 10 毫克活性組成份與 0.5 毫升二甲亞碸混合，且將該濃縮物用水稀釋至所需之濃度。

【0275】 將含有糖溶液與所需濃度之活性組成份配製物處理過之海棉的容器裝入 10 隻成年家蠅。

【0276】 於 2 天後，測定以%計之殺死率。100%意指所有的蒼蠅已被殺死或擊倒；0%意指沒有任何蒼蠅被殺死或擊倒。

【0277】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之化合物，以 100 ppm 之施用率施用時展示 100%之效益。

【0278】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-48-2，以 20 ppm 之施用率施用時展示 100%之效益。

用於接觸試驗之活性組成份溶液及試驗管塗層之製備

【0279】 將 9 毫克活性組成份首先溶解於 1 毫升丙酮 p.a.中且然後用丙酮 p.a.稀釋至所需之濃度，用於該試驗管之塗層。將 250 微升該溶液於搖滾滾筒上(模型 L202，Labinco；於通風櫥中以 30 rpm 搖擺旋轉達 2 小時)，藉由轉動及搖擺均勻分佈於試驗管之內壁及底

座上(25 毫升壓蓋式樣品瓶(Fisher Scientific 公司，訂單編號 320 55 60)。用 900 ppm 活性組成份溶液及內表面積 44.7 cm^2給予均勻之分佈，而達到 5 微克/平方厘米以面積計之劑量。

貓櫛首蚤–用跳蚤體外接觸試驗(CTECFE)

【0280】 將用於本發明經鹵素取代式(I)化合物之製備實例，用外寄生昆蟲(此處係貓蚤)進行試驗其等之接觸效率。為了此目的，將壓蓋式樣品瓶用 250 微升如上所述之活性組成份之丙酮溶液塗敷。於該溶劑蒸發後，將該管裝入 5-10 隻跳蚤(成年貓櫛首蚤)，用帶孔的塑膠蓋予以密封且以水平位置於室溫及周遭濕度下培育。於 48 小時後，測定效益(擊倒與死亡率)及死亡率。為此，將該試管直立且將跳蚤敲擊至該管之底部。於底部保持不動或以不協調方式移動之跳蚤被認為是死亡或或擊倒(垂死)。

【0281】 一物質於該試驗中以 5 微克/平方毫米之施用率施用時，若達到 80%效益，係表示良好的效益對抗貓櫛首蚤。100%死亡率意指所有的跳蚤已被殺死，100%效益意指所有的跳蚤皆垂死(擊倒)或死亡。0%效益意指沒有跳蚤受到傷害。

【0282】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-48-2，以 1 微克/平方毫米之施用率施用時展示 100%之效益。

貓櫛首蚤–體外接觸試驗用成年貓蚤

【0283】 將 9 毫克活性組成份首先溶解於 1 毫升丙酮 p.a.中且然後用丙酮 p.a.稀釋至所需之濃度，用於該試管之塗層。將 250 微升溶液藉由轉動與搖擺於定軌震盪器上(以 30 rpm 搖擺旋轉達 2 小時)均勻分佈於 25 毫升試管之內壁及基底上。用 900 ppm 活性組成份溶液及內表面積 44.7 cm^2給予均勻之分佈，而達到 5 微克/平方厘米以面積計之劑量。

【0284】 於該溶劑蒸發後，將該試管裝入 5-10 隻成年貓蚤(貓櫛首蚤)，用帶孔的塑膠蓋予以密封且以水平位置於室溫及周遭濕度下培育。於 48 小時後，測定效益。為此，將該試管直立且將跳蚤敲擊至該

管之底部。於底部保持不動或以不協調方式移動之跳蚤被認為是死亡或垂死。

【0285】 一物質於該試驗中以 5 微克/平方毫米之施用率施用時，若達到至少 80%效益，係表示良好的效益對抗貓櫛首蚤。100%效益意指所有的跳蚤皆死亡或垂死。0%效益意指沒有跳蚤受到傷害。

【0286】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-T48-2、I-T48-3、I-T48-4，以 5 微克/平方毫米之施用率施用時展示 100%之效益。

血紅扇頭蜱-體外接觸試驗用棕色犬蜱(RHIPSA)

【0287】 將用於本發明經鹵素取代式(I)化合物之製備實例，用外寄生蜘蛛(此處係棕色犬蜱)進行試驗其等之接觸效率。為了此目的，將壓蓋式樣品瓶用 250 微升如上所述之活性組成份的丙酮溶液塗敷。於該溶劑蒸發後，將該試管裝入 5-10 隻蜱(成年血紅扇頭蜱)，用帶孔的塑膠蓋予以密封且以水平位置於黑暗中於室溫及周遭濕度下培育。於 48 小時後，測定效益(擊倒與死亡率)及死亡率。為此，將該蜱敲擊至該管之地板且於熱板上於 45-50°C 培育不超過 5 分鐘。於地板上保持不動或以不協調方式移動，無法刻意避免熱氣而向上攀爬之蜱被認為是死亡或擊倒(垂死)。

【0288】 一物質於該試驗中以 5 微克/平方毫米之施用率施用時，若達到 80%效益，係表示的良好效益對抗血紅扇頭蜱。

【0289】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-48-2，以 1 微克/平方毫米之施用率施用時展示 80%之效益。

【0290】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-48-1，以 1 微克/平方毫米之施用率施用時展示 100%之效益。

血紅扇頭蜱-體外接觸試驗用成年棕色犬蜱

【0291】 將 9 毫克活性組成份首先溶解於 1 毫升丙酮 p.a.中且然後用丙酮 p.a.稀釋至所需之濃度，用於該試管之塗層。將 250 微升溶液於定軌震盪器上(以 30 rpm 搖擺旋轉達 2 小時)，藉由轉動與搖擺均

勻分佈於 25 毫升試管之內壁及基底上。用 900 ppm 活性組成份溶液及內表面積 44.7 cm^2給予均勻之分佈，而達到 5 微克/平方厘米以面積計之劑量。

【0292】 於該溶劑蒸發後，將該試管裝入 5-10 隻成年犬蜱(血紅扇頭蜱)，用帶孔的塑膠蓋予以密封且以水平位置於黑暗中於室溫及周遭濕度下培育。於 48 小時後，測定效益。為此，將該蜱敲擊至該管之地板且於熱板上於 45-50°C 培育不超過 5 分鐘。於地板上保持不動或以不協調方式移動，無法刻意避免熱氣而向上攀爬之蜱被認為是死亡或垂死。

【0293】 一物質於該試驗中以 5 微克/平方毫米之施用率施用時，若達到至少 80%效益，係表示良好的效益對抗血紅扇頭蜱。100%效益意指所有的蜱已死或垂死。0%效益意指沒有任何蜱受到傷害。

【0294】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-T48-3、I-T48-4、I-T48-7，以 5 微克/平方毫米之施用率施用時展示 100%之效益。

【0295】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-2，以 5 微克/平方毫米之施用率施用時展示 80%之效益。

斑點蜱-試驗

溶劑： 二甲亞碸

【0296】 為了製造適當之活性組成份配製物，將 10 毫克活性組成份與 0.5 毫升二甲亞碸混合，且將該濃縮物用水稀釋至所需之濃度。

【0297】 將蜱幼蟲(斑點蜱)放入帶孔的塑膠燒杯中且浸入所需之濃度中達 1 分鐘。將該蜱於濾紙上轉移至培養皿中且存放於氣候控制之櫃中。

【0298】 於 42 天後，測定以%計之殺死率。100%意指所有的蜱已被殺死；0%意指沒有任何蜱被殺死。

【0299】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-T48-7、I-T48-8，以 100 ppm 之施用率施用時展示 100%之效益。

【0300】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-3，

S

以 100 ppm 之施用率施用時展示 90%之效益。

微小牛蜱-浸漬試驗

試驗動物：牛蜱(微小牛蜱)帕克赫斯特(Parkhurst)品系，SP-抗性

溶劑：二甲亞碸

【0301】 將 10 毫克活性組成份溶解於 0.5 毫升二甲亞碸中。為了製當適當配製物之目的，將該活性組成份溶液於每一情況中用水稀釋至所需之濃度。

【0302】 將此活性組成份配製物吸移至試管中。將 8-10 隻成年吮足血之雌性牛蜱(微小牛蜱)轉移至具有孔洞之其他管中。將該管浸入活性組成份配製物中，且將該蜱全部充分弄濕。於該液體流出後，將該蜱於濾盤上轉移至塑膠盤中且存放於氣候控制之房間內。

【0303】 效益係於產下受精卵 7 天後進行評估。將非目視可見之受精蛋存儲於氣候控制櫃中直到於約 42 天後幼蟲孵出。100%之效益意指沒有任何蜱產下受精卵；0%意指所有的蛋為受精者。

【0304】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-T48-7、I-T48-8，以 100 ppm 之施用率施用時展示 100%之效益。

【0305】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-3，以 100 ppm 之施用率施用時展示 90%之效益。

微小牛蜱-注射試驗

溶劑： 二甲亞碸

【0306】 為了製造適當之活性組成份配製物，將 10 毫克活性組成份與 0.5 毫升溶劑混合且將該濃縮物用溶劑稀釋至所需之濃度。

【0307】 將 1 微升活性組成份溶液注入 5 隻吮足血之成年雌性牛蜱(微小牛蜱)的腹部。將該等動物轉移至各皿中且保持於氣候控制之房間內。

【0308】 效益係於產下受精卵 7 天後進行評估。將非目視可見之受精蛋存儲於氣候控制櫃中直到於約 42 天後幼蟲孵出。100%之效益意指沒有任何蜱產下受精卵；0%意指所有的蛋為受精者。

【0309】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-T48-2、I-T48-3、I-T48-4、I-T48-5、I-T48-6、I-T48-7、I-T48-8，以 20 微克/動物之施用率施用時展示 100%之效益。

貓櫛首蚤-口服試驗

溶劑： 二甲亞碸

【0310】 為了製造適當活性組成份配製物之目的，將 10 毫克活性組成份與 0.5 毫升二甲亞碸混合。用檸檬酸化牛血稀釋而得到所需之濃度。

【0311】 將約 20 隻未餵食之成年貓蚤(貓櫛首蚤)放進用紗布封閉頂部與底部之小室中。將底端用封口膜封閉之金屬管柱置於該小室中。該圓筒含有血液/活性組成份製劑，其可由該跳蚤經由封口膜而吸進。

【0312】 於 2 天後，測定以%計之殺死率。100%意指所有的跳蚤已被殺死；0%意指沒有跳蚤被殺死。

【0313】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-T48-2、I-T48-3、I-T48-4、I-T48-5、I-T48-6、I-T48-7、I-T48-8，以 100 ppm 之施用率施用時展示 100%之效益。

【0314】 為了製造適當之活性組成份配製物，將 10 毫克活性組成份與 0.5 毫升二甲亞碸混合，且將該濃縮物用水稀釋至所需之濃度。

【0315】 將約 20 隻澳大利亞羊綠頭蒼蠅(銅綠蠅)之 L1 幼蟲轉移至含有碎馬肉及所需濃度之活性組成份製劑之試驗容器中。

【0316】 於 2 天後，測定以%計之殺死率。100%意指所有的幼蟲已被殺死；0%意指沒有任何幼蟲被殺死。

【0317】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-T48-2、I-T48-3、I-T48-4、I-T48-5、I-T48-6、I-T48-7，以 100 ppm 之施用率施用時展示 100%之效益。

家蠅-試驗

溶劑： 二甲亞碸

S

【0318】 為了製造適當之活性組成份配製物，將 10 毫克活性組成份與 0.5 毫升二甲亞碸混合，且將該濃縮物用水稀釋至所需之濃度。

【0319】 將含有糖溶液與所需濃度之活性組成份配製物處理過之海棉的容器裝入 10 隻成年家蠅(家蠅)。

【0320】 於 2 天後，測定以%計之殺死率。100%意指所有的蒼蠅皆已被殺死；0%意指沒有任何蒼蠅被殺死。

【0321】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-T48-2、I-T48-3、I-T48-4、I-T48-5、I-T48-6、I-T48-7，以 100 ppm 之施用率施用時展示 100%之效益。

桃蚜-噴霧試驗

溶劑： 78 重量份丙酮

1.5 重量份二甲基甲醯胺

【0322】 為了製造適當之活性組成份配製物，將 1 重量份活性組成份使用指定重量份之溶劑溶解且加入含有 1000 ppm 乳化劑濃度之水直到獲得所需之濃度。為了產生另外的試驗濃度，將該製劑用含乳化劑的水予以稀釋。

【0323】 將用所有生長階段之桃蚜(Myzus persicae)感染之結球白菜(北京白菜)之葉盤用所需濃度之活性組成份配製物予以噴灑。

【0324】 於 6 天後，測定以%計之效益。100%意指所有的蚜蟲皆已被殺死；0%意指沒有任何蚜蟲被殺死。

【0325】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-7、I-T48-8，以 500 克/公頃之施用率施用時展示 100%之效益。

【0326】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-T48-2，以 100 克/公頃之施用率施用時展示 100%之效益。

辣根猿葉甲-噴霧試驗

溶劑： 78.0 重量份丙酮

1.5 重量份二甲基甲醯胺

乳化劑： 烷基芳基聚乙二醇醚

【0327】 為了製造適當之活性組成份配製物，將 1 重量份活性組成份使用指定重量份之溶劑溶解且加入含有 1000 ppm 乳化劑濃度之水直到獲得所需之濃度。為了產生另外的試驗濃度，將該製劑用含乳化劑的水予以稀釋。

【0328】 將結球白菜葉(北京白菜)之葉盤用所需濃度之活性組成份配製物噴灑，且於乾燥後，加入芥菜甲蟲(辣根猿葉甲)之幼蟲。

【0329】 於 7 天後，測定以%計之效益。100%意指所有的甲蟲幼蟲皆已被殺死；0%意指沒有甲蟲幼蟲被殺死。

【0330】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-7、I-T48-8，以 500 克/公頃之施用率施用時展示 100%之效益。

【0331】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-T48-2、I-T48-3、I-T48-4、I-T48-5、I-T48-6，以 100 克/公頃之施用率施用時展示 100%之效益。

草地夜蛾-噴霧試驗

溶劑： 78.0 重量份丙酮

1.5 重量份二甲基甲醯胺

乳化劑：烷基芳基聚乙二醇醚

【0332】 為了製造適當之活性組成份配製物，將 1 重量份活性組成份使用指定重量份之溶劑溶解且加入含有 1000 ppm 乳化劑濃度之水直到獲得所需之濃度。為了產生另外的試驗濃度，將該製劑用含乳化劑的水予以稀釋。

【0333】 將玉蜀黍(Zea mays)之葉盤用所需濃度之活性組成份配製物噴灑，且於乾燥後，加入夜盜蛾(草地夜蛾)之毛蟲。

【0334】 於 7 天後，測定以%計之效益。100%意指所有的毛蟲皆已被殺死；0%意指沒有毛蟲被殺死。

【0335】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-7、I-T48-8，以 500 克/公頃之施用率施用時展示 100%之效益。

【0336】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-T48-2、I-T48-3、I-T48-4、I-T48-5、I-T48-6，以 100 克/公頃之施

用率施用時展示 100%之效益。

二點葉蟎-噴霧試驗，OP-抗性

溶劑： 78.0 重量份丙酮

1.5 重量份二甲基甲醯胺

乳化劑：烷基芳基聚乙二醇醚

【0337】 為了製造適當之活性組成份配製物，將 1 重量份活性組成份使用指定重量份之溶劑溶解且加入含有 1000 ppm 乳化劑濃度之水直到獲得所需之濃度。為了產生另外的試驗濃度，將該製劑用含乳化劑的水予以稀釋。

【0338】 將用所有生長階段之溫室紅葉蟎(二點葉蟎)感染之豆葉(菜豆(Phaseolus vulgaris))葉盤用所需濃度之活性組成份配製物予以噴灑。

【0339】 於 6 天後，測定以%計之效益。100%意指所有的葉蟎皆已被殺死；0%意指沒有任何葉蟎被殺死。

【0340】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-7、I-T48-8 以 500 克/公頃之施用率施用時展示 100%之效益。

【0341】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-T48-2、I-T48-3、I-T48-4、I-T48-6，以 100 克/公頃之施用率施用時展示 100%之效益。

按蚊屬試驗(ANPHFU 表面處理)

溶劑： 丙酮 + 2000 ppm 油菜籽油甲基酯(RME)

【0342】 為了製造適當之活性組成份配製物，將該活性組成份溶解於該溶劑中(2 毫克/毫升)。將該活性組成份配製物吸移至釉面瓦上，且於其乾掉後，將催命按蚊品系 FUMOZ-R 物種之成年蚊子(韓特等，Med Vet Entomol. 2005 年 9 月；19(3)：271-5)置於處理過之瓦上。曝露時間為 30 分鐘。

【0343】

【0344】 與處理過之表面接觸 24 小時後，測定以%計之死亡率。100%

意指所有的蚊子皆已被殺死；0%意指沒有任何蚊子被殺死。

【0345】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1，以 100 毫克/平方米之施用率施用時展示 90-100%之效益。

【0346】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T-48-4，以 20 毫克/平方米之施用率施用時展示 90-100%之效益。

伊蚊屬試驗(AEDSAE 表面處理)

溶劑： 丙酮 + 2000 ppm 油菜籽油甲基酯(RME)

【0347】 為了製造適當之活性組成份配製物，將該活性組成份溶解於溶劑中(2 毫克/毫升)。將該活性組成份配製物吸移至釉面瓦上，且於其乾掉後，將埃及伊蚊品系 MONHEIM 物種之成年蚊子置於該處理過之瓦上。曝露時間為 30 分鐘。

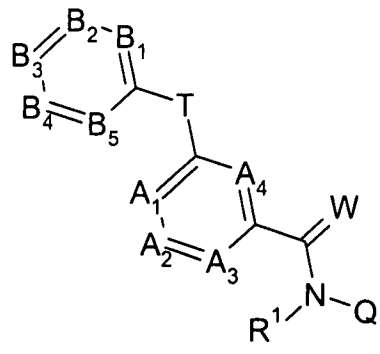
【0348】 與處理過之表面接觸 24 小時後，測定以%計之死亡率。100%意指所有的蚊子已被殺死；0%意指沒有任何蚊子被殺死。

【0349】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-T48-2、I-T48-4，以 100 毫克/平方米之施用率施用時展示 90-100%之效益。

【0350】 於該試驗中，例如，來自於製備實例之下列化合物：I-T48-1、I-T48-2、I-T48-4，以 20 毫克/平方米之施用率施用時展示 90-100%之效益。

申請專利範圍

1. 一種式(I)化合物，



(I)

其中，

R^1 為 H、於每一情況中任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-炔基、C_3-C_7-環烷基、C_1-C_6-烷基羰基、C_1-C_6-烷氧基羰基、芳基(C_1-C_3)-烷基、雜芳基(C_1-C_3)-烷基，

下列之部分如下：

A_1 為 CR^2 或 N，

A_2 為 CR^3 或 N，

A_3 為 CR^4 或 N，

A_4 為 CR^5 或 N，

B_1 為 CR^6 或 N，

B_2 為 CR^7 或 N，

B_3 為 CR^8 或 N，

B_4 為 CR^9 或 N，且

B_5 為 CR^{10} 或 N，

但 A_1 至 A_4 部分中不超過 3 個為 N 且 B_1 至 B_5 部分中不超過 3 個同時為 N；

R^2、R^3、R^4、R^5、R^6、R^7、R^9 及 R^{10} 各自獨立為 H、鹵素、氰基、硝基、於每一情況中任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_3-C_6-環烷基、C_1-C_6-烷氧基、N-C_1-C_6-烷氧基亞胺基-C_1-C_3-烷基、C_1-C_6-烷基硫烷基、C_1-C_6-烷基亞磺醯、C_1-C_6-烷基磺醯、N-C_1-C_6-烷基胺基或 N,N-二-C_1-C_6-烷基胺基；

如果沒有 A_2 及 A_3 部分為 N，則 R^3 及 R^4 與其等所結合之碳原子

一起可形成含有 0、1 或 2 個氮原子及/或 0 或 1 個氧原子及/或 0 或 1 個硫原子之 5-或 6-員環，或

如果沒有 A_1 及 A_2 部分為 N，則 R^2 及 R^3 與其等所結合之碳原子一起可形成含有 0、1 或 2 個氮原子之 6-員環；

R^8 為鹵素、氰基、硝基、於每一情況中任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_3-C_6-環烷基、C_1-C_6-烷氧基、N-C_1-C_6-烷氧基亞胺基-C_1-C_3-烷基、C_1-C_6-烷基硫烷基、C_1-C_6-烷基亞磺醯、C_1-C_6-烷基磺醯、N-C_1-C_6-烷基胺基或 N,N-二-C_1-C_6-烷基胺基，較佳為鹵素或經鹵素取代之 C_1-C_4-烷基；

W 為 O 或 S；

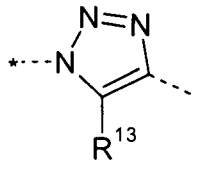
Q 為 H、甲醯基、羥基、胺基或於每一情況中任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_2-C_6-烯基、C_2-C_6-炔基、C_3-C_6-環烷基、C_1-C_5-雜環烷基、C_1-C_4-烷氧基、C_1-C_6-烷基-C_3-C_6-環烷基、C_3-C_6-環烷基-C_1-C_6-烷基、C_6-,C_{10}-C_{14}-芳基、C_1-C_5-雜芳基、C_6-,C_{10}-,C_{14}-芳基-C_1-C_3-烷基、C_1-C_5-雜芳基-C_1-C_3-烷基、N-C_1-C_4-烷基胺基、N-C_1-C_4-烷基羰基胺基，或 N,N-二-C_1-C_4-烷基胺基；或

為任意多-V-取代之不飽和 6-員碳環；或

為任意多-V-取代之不飽和 5-或 6-員雜環，其中，

V 獨立為鹵素、氰基、硝基、於每一情況中任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_1-C_4-烯基、C_1-C_4-炔基、C_3-C_6-環烷基、C_1-C_6-烷氧基、N-C_1-C_6-烷氧基亞胺基-C_1-C_3-烷基、C_1-C_6-烷基硫烷基、C_1-C_6-烷基亞磺醯、C_1-C_6-烷基磺醯，或 N,N-二-(C_1-C_6-烷基)胺基；

T 每一情況中為含有 3 個雜原子之任意經取代之 5-員雜芳族，該雜原子較佳選自於基團包括 N、O 及 S，

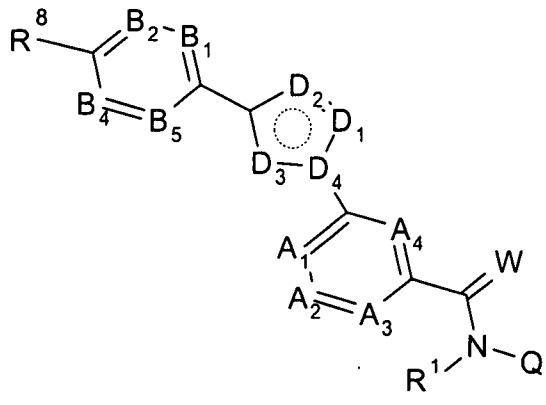


於 T 不為 之條件下，其中，

R^{13} 為 H、鹵素、C_1-C_4-烷基、經鹵素取代之 C_1-C_6-烷基或氰基，

及式(I)化合物之鹽、N-氧化物及互變異構體形式。

2. 如請求項 1 之化合物，其中該化合物為式(Ia)化合物



(Ia)

其中

D_1、D_2及 D_3各自獨立為 C-R^{11}或雜原子，較佳為 C-R^{11}或選自於 N、O 或 S 之雜原子；且

D_4 為 C 或選自於 N 之雜原子；

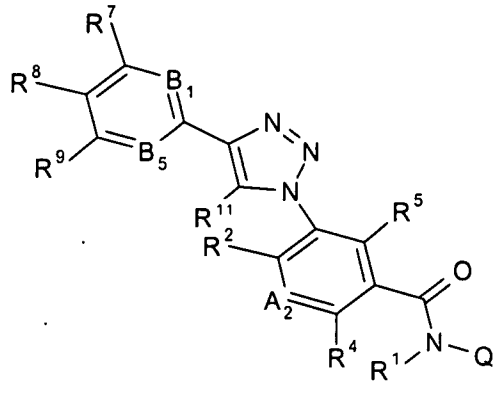
其中選自於 D_1、D_2、D_3及 D_4之 3 個部分為雜原子；

R^{11} 獨立為 H、鹵素、氰基、硝基、胺基或於每一情況中任意經取代之 C_1-C_6-烷基、C_1-C_6-烷基氧基、C_1-C_6-烷基羰基、C_1-C_6-烷基硫烷基、C_1-C_6-烷基亞磺醯、C_1-C_6-烷基磺醯，較佳為 H，

◌ 為芳族系；且

R^1、Q、W、A_1、A_2、A_3、A_4、B_1、B_2、B_3、B_4及 B_5係各自如請求項第 1 項中所定義者，其中選自於 A_1、A_2、A_3、A_4中不超過 1 個部分為 N 且選自於 B_1、B_2、B_3、B_4及 B_5中不超過 1 個部分為 N。

3. 如請求項 1 或 2 之化合物，其中該化合物為式(Ie)化合物



(Ie)

其中 R^1、R^2、R^4、R^5、R^7、R^8、R^9、R^{11}、Q、A_2、B_1及 B_5係各自如請求項 1 所定義者。

4. 如請求項 1 至 3 中任一項之化合物，其中 R^{11}獨立為 H。

5. 如請求項 1 至 4 中任一項之化合物，其中 R^6、R^7、R^9 及 R^{10} 各自獨立為 H、鹵素、氰基、硝基、於每一情況中任意經取代之 C_1-C_4-烷基、C_3-C_4-環烷基、C_1-C_4-烷氧基、N-烷氧基亞胺基烷基、C_1-C_4-烷基硫烷基、C_1-C_4-烷基亞磺醯、C_1-C_4-烷基磺醯、N-C_1-C_4-烷基胺基、N,N-二-C_1-C_4-烷基胺基。
6. 如請求項 1 至 5 中任一項之化合物，其中 R^2、R^3、R^4 及 R^5 各自獨立為 H、鹵素、氰基、硝基、於每一情況中任意經取代之 C_1-C_4-烷基、C_3-C_4-環烷基、C_1-C_4-烷氧基、N-C_1-C_4-烷氧基亞胺基-C_1-C_4-烷基、C_1-C_4-烷基硫烷基、C_1-C_4-烷基亞磺醯、C_1-C_4-烷基磺醯、N-C_1-C_4-烷基胺基或 N,N-二-C_1-C_4-烷基胺基。
7. 如請求項 1 至 6 中任一項之化合物，其中 A_1 至 A_4 及 B_1 至 B_5 部分如下：

   A_1 為 C-H，

   A_2 為 CR^3 或 N，

   A_3 為 CR^4，

   A_4 為 C-H，

   B_1 為 CR^6 或 N，

   B_2 為 C-H，

   B_3 為 CR^8，

   B_4 為 C-H 且

   B_5 為 CR^{10} 或 N。
8. 如請求項 1 至 7 中任一項之化合物，其中 R^1 為 H。
9. 如請求項 1 至 8 中任一項之化合物，其中 Q 為經氟取代之 C_1-C_4-烷基、C_3-C_4-環烷基、任意經氰基或氟取代之 C_3-C_4-環烷基、C_4-C_6-雜環烷基、1-氧撐噻坦(oxidothietan)-3-基、1,1-二氧撐噻坦-3-基、苄基、吡啶-2-基甲基、甲基磺醯或 2-酮基-2-(2,2,2-三氟乙基胺基)乙基。
10. 如請求項 1 至 9 中任一項之化合物，其中 Q 為 2,2,2-三氟乙基、2,2-二氟乙基、3,3,3-三氟丙基、環丙基、環丁基、環丙基、環丁基、1-氰基-環丙基、反式-2-氟環丙基或順式-2-氟環丙基、噁坦(oxetan)-3-基、噻坦-3-基、1-氧撐噻坦(oxidothietan)-3-基、1,1-二氧撐噻坦-3-基、苄基、吡啶-2-基甲基、甲基磺醯或 2-酮基-2-(2,2,2-三氟乙基胺基)乙基。

S

11. 如請求項 1 至 10 中任一項之化合物，其中 R^8 為鹵素或經鹵素取代之 C_1-C_4-烷基。
12. 一種殺蟲組成物，其特徵在於含有至少一種根據請求項 1 至 11 中任一項之式(I)化合物及增充劑及/或表面活性物質。
13. 一種用於保護基因轉殖或習用種子及由此產生之植物免於害蟲侵襲之方法，其特徵在於該種子係用至少一種根據請求項 1 至 11 中任一項之化合物處理。
14. 一種根據請求項 1 至 11 中任一項之化合物或根據請求項 12 之殺蟲組成物於控制害蟲之用途。
15. 一種種子，其中如請求項 1 至 11 中任一項之化合物係已施用至該種子作為塗層之組份或作為附加層或除塗層外之附加層。

5