



(19) 中華民國智慧財產局

(12) 發明說明書公告本

(11) 證書號數：TW I468407 B

(45) 公告日：中華民國 104 (2015) 年 01 月 11 日

(21) 申請案號：101117322

(22) 申請日：中華民國 98 (2009) 年 01 月 16 日

(51) Int. Cl. : C07D471/04 (2006.01)

A01N43/90 (2006.01)

A61K31/519 (2006.01)

A01P7/00 (2006.01)

A01P17/00 (2006.01)

A61P33/14 (2006.01)

A01C1/08 (2006.01)

(30) 優先權：2008/02/06 美國

61/063,789

2008/04/09 美國

61/043,428

(71) 申請人：杜邦股份有限公司 (美國) E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY (US)
美國(72) 發明人：荷利約克二世 卡洛 威廉 HOLYOKE, CALEB WILLIAM JR. (US)；桐 麥 瀚
堤 TONG, MY-HANH THI (US)；寇茲 瑞德 亞倫 COATS, REED AARON
(US)；張溫明 ZHANG, WENMING (CN)；麥肯 史帝芬 佛萊德烈克 MCCANN,
STEPHEN FREDERICK (US)；山 多明尼克 明 泰克 CHAN, DOMINIC MING-
TAK (US)；帕胡茲基二世 湯瑪斯 法蘭西斯 PAHUTSKI, THOMAS FRANCIS
JR. (US)

(74) 代理人：陳傳岳；郭雨嵐

(56) 參考文獻：

US 4152427

US 5089501

US 5149810

審查人員：黃智詮

申請專利範圍項數：14 項 圖式數：0 共 276 頁

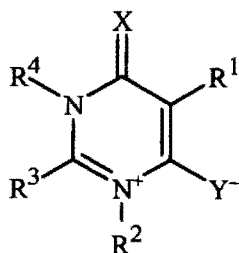
(54) 名稱

中離子農藥

MESOIONIC PESTICIDES

(57) 摘要

本發明揭示式 1 化合物，

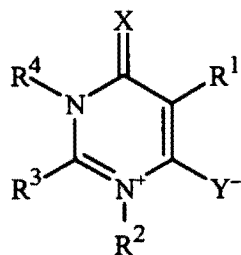


1

其中 X 為 O、S 或 NR²²；Y 為 O、S 或 NR²²；R¹、R²、R³、R⁴ 及 R²² 係如本揭示中所定義。

本發明亦揭示含有式 1 化合物之組合物，及用於控制無脊椎害蟲之方法，該方法包含使該無脊椎害蟲或其環境與生物學有效量之本發明化合物或組合物接觸。

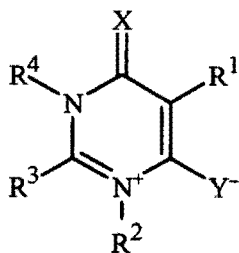
Disclosed are compounds of Formula 1 ,



1

wherein X is O, S or NR²² ; Y is O, S or NR²² ; and R¹ , R² , R³ , R⁴ and R²² are as defined in the disclosure.

Also disclosed are compositions containing the compounds of Formula 1 and methods for controlling an invertebrate pest comprising contacting the invertebrate pest or its environment with a biologically effective amount of a compound or a composition of the invention.



1

發明專利說明書

公告本

分割案

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：

101117322 (由98101726分割)

※申請日：

98.1.16

※IPC 分類：

C07D 471/04 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

A61K 31/519 (2006.01)

A01P 7/00 (2006.01)

A01P 17/00 (2006.01)

A61P 33/14 (2006.01)

A01C 1/08 (2006.01)

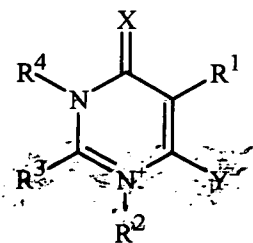
一、發明名稱：(中文/英文)

中離子農藥

MESOIONIC PESTICIDES

二、中文發明摘要：

本發明揭示式1化合物，



1

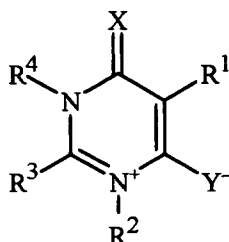
其中

X為O、S或NR²²；Y為O、S或NR²²；R¹、R²、R³、R⁴及R²²係如本揭示中所定義。

本發明亦揭示含有式1化合物之組合物，及用於控制無脊椎害蟲之方法，該方法包含使該無脊椎害蟲或其環境與生物學有效量之本發明化合物或組合物接觸。

三、英文發明摘要：

Disclosed are compounds of Formula 1,



1

wherein

X is O, S or NR²²;

Y is O, S or NR²²;

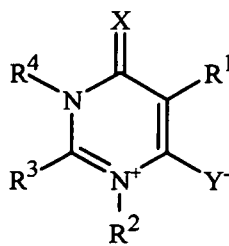
and R¹, R², R³, R⁴ and R²² are as defined in the disclosure.

Also disclosed are compositions containing the compounds of Formula 1 and methods for controlling an invertebrate pest comprising contacting the invertebrate pest or its environment with a biologically effective amount of a compound or a composition of the invention.

四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：(無)

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

1

六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

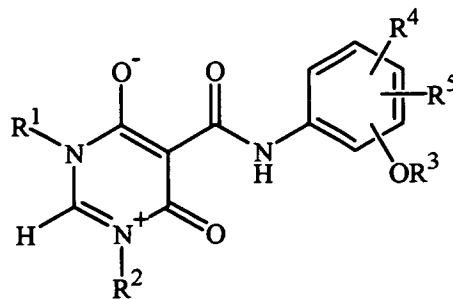
本發明係關於適於農藝、非農藝及動物健康用途之某些嘧啶鎘化合物及其組合物、其用於控制農藝環境與非農藝環境兩者中之無脊椎害蟲(諸如，節肢動物)及治療動物之寄生蟲感染或一般環境中之侵染之方法。

【先前技術】

無脊椎害蟲之控制對實現高作物效率而言極為重要。無脊椎害蟲對生長中及儲存之農作物的破壞可導致生產率明顯下降，且因而導致消費者成本增加。林業、溫室作物、觀賞植物、苗圃作物、儲存食物及纖維產品、家畜、家庭、草皮、木材產品及公共健康中無脊椎害蟲之控制亦為重要的。雖然出於此等目的可購得許多產品，但持續需要更有效、成本更低、毒性更小、更具環境安全性或具有不同作用位點之新穎化合物。

在動物健康中，尤其在食品生產領域及伴侶動物中動物寄生蟲之控制係必需的。現有處理及寄生蟲控制的方法因對目前市售的多種殺寄生蟲劑抗性增加而日漸顯得不足。因此，需要發現控制動物寄生蟲之更有效方式。

美國專利第5,151,427號揭示式i之中離子嘧啶鎘化合物作為驅蟲劑



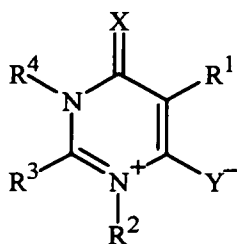
i

其中， R^1 及 R^2 獨立地為 C_1 - C_6 烷基， R^3 為雜芳族6員環，且 R^4 及 R^5 獨立地為氫或 C_1 - C_4 烷基。

本發明之嘓啶鎘化合物未在此公開案中揭示。

【發明內容】

本發明係針對式1化合物(包括所有幾何及立體異構體)及含有其之組合物及其用於控制無脊椎害蟲之用途：



1

其中

X為O、S或 NR^{22} ；

Y為O、S或 NR^{22} ；

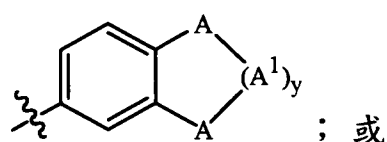
R^1 為H、鹵素、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 $CR^{24}=C(R^{24})R^{10}$ 或 $C\equiv CR^{10}$ ；或

R^1 為 C_3 - C_7 環烷基、 C_4 - C_8 環烷基烷基或 C_5 - C_7 環烯基，各自視情況經1至4個獨立選自由鹵素、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 烷氧基、1個環丙基、1個 CF_3 及1個 OCF_3 組成之群之取代基取代；或

R^1 為苯基、萘基或5或6員雜芳環，各自視情況經1至3個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氫基、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4

鹵烷基、C₂-C₄鹵烯基、C₂-C₄烷基羰基、C₂-C₄鹵烷基羰基、C₂-C₄烷氧基羰基、C₂-C₄烷基胺基羰基、C₃-C₇二烷基胺基羰基、C(O)N—(—CH₂Z²CH₂—)、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₂-C₆烷氧基烷基、S(O)_nR¹²、S(O)₂R¹³、C₁-C₄烷基胺基、C₂-C₆二烷基胺基、SF₅、Si(CH₃)₃、CHO、羥基、OC(O)R¹⁹及N(R²⁰)C(O)R¹⁹；或

R¹為



R¹為C(X¹)R¹⁸、C(=NOR²³)R¹⁸或C(O)NR¹⁶R^{18a}；或

R¹為8至10員雜芳族雙環環系統，其視情況在碳環成員上經至多3個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、SF₅、C₁-C₄烷基、C₂-C₄烯基、C₂-C₄炔基、C₁-C₄鹵烷基、C₂-C₄烷基羰基、C₂-C₄鹵烷基羰基、C₂-C₄烷氧基羰基、C₂-C₄烷基胺基羰基、C₃-C₇二烷基胺基羰基、C(O)N—(—CH₂Z²CH₂—)、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₂-C₆烷氧基烷基、S(O)_nR¹²、S(O)₂R¹³、C₁-C₄烷基胺基、C₂-C₆二烷基胺基、Si(CH₃)₃、CHO、羥基、OC(O)R¹⁹及N(R²⁰)C(O)R¹⁹，且視情況在氮環成員上經甲基取代；或

R¹為苯基或5或6員雜芳環，各自經GQ¹取代且視情況進一步經1或2個獨立選自由以下各物組成之群之取代基取

代：鹵素、氰基、硝基、 SF_5 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 炔基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 鹵烷基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷氧基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基胺基羰基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 二烷基胺基羰基、 $\text{C}(\text{O})\text{N}-(\text{---CH}_2\text{Z}^2\text{CH}_2\text{---})$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷氧基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 烷氧基烷基、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{12}$ 、 $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基胺基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 二烷基胺基、 $\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ 、 CHO 、羥基、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{19}$ 及 $\text{N}(\text{R}^{20})\text{C}(\text{O})\text{R}^{19}$ ；

A各自獨立地為 $\text{C}(\text{R}^{16})_2$ 、 O 、 $\text{S}(\text{O})_n$ 或 NR^{15} ；

A^1 各自獨立地為 $\text{C}(\text{R}^{17})_2$ ；

X^1 為 O 或 S ；

G為一直接鍵、 O 、 $\text{S}(\text{O})_n$ 、 NH 、 $\text{N}(\text{CH}_3)$ 、 CH_2 、 CH_2O 、 OCH_2 、 $\text{C}(\text{O})$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{O}$ 、 $\text{OC}(\text{O})$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}$ 或 $\text{NHC}(\text{O})$ ；

Q^1 為苯基或5或6員雜芳環，各自視情況經1至3個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 炔基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 鹵烷基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷氧基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基胺基羰基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 二烷基胺基羰基、 $\text{C}(\text{O})\text{N}-(\text{---CH}_2\text{Z}^2\text{CH}_2\text{---})$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷氧基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 烷氧基烷基、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{12}$ 、 $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基胺基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 二烷基胺基、 SF_5 、 $\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ 、 CHO 、羥基、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{19}$ 及 $\text{N}(\text{R}^{20})\text{C}(\text{O})\text{R}^{19}$ ；

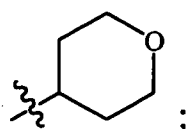
R^2 為 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 鹵烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 烯基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 鹵烯基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 炔基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 鹵炔基、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^{21}$ 、

$CR^5R^6CH_2OR^{21}$ 、 $CR^5R^6CH_2CH_2OR^{21}$ 、 $CR^5R^6CH_2S(O)_nR^{21}$ 或
 $CR^5R^6CH_2CH_2S(O)_nR^{21}$ ；或

R^2 為 C_3 - C_6 環烷基或 C_4 - C_7 環烷基烷基，各自視情況經 1 至 4
 個選自由鹵素、 C_1 - C_2 烷基、1 個環丙基及 1 個 CF_3 組成
 之群之取代基取代；或

R^2 為 CR^5R^6Q ；或

R^2 為



R^3 為 H、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 鹵烯
 基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 鹵炔基或 $C\equiv CR^{10}$ ；或

R^3 為 C_3 - C_6 環烷基或 C_4 - C_7 環烷基烷基，各自視情況經 1 至 4
 個獨立選自由鹵素、 C_1 - C_2 烷基、1 個環丙基及 1 個 CF_3
 組成之群之取代基取代；或

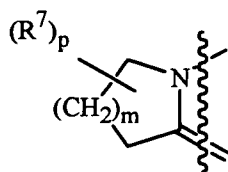
R^3 為苯基、萘基或 5 或 6 員雜芳環，各自視情況經 1 或 2 個獨
 立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰
 基、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4
 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷
 氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰
 基、 $C(O)N-(CH_2Z^2CH_2)-$ 、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷
 氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 $S(O)_2R^{13}$ 、 C_1 - C_4
 烷基胺基及 C_2 - C_6 二烷基胺基；

R^4 為 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 鹵烯
 基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 鹵炔基或 $C\equiv CR^{10}$ ；或

R^4 為 C_3 - C_6 環烷基或 C_4 - C_7 環烷基烷基，各自視情況經 1 至 4 個獨立選自由鹵素、 C_1 - C_2 烷基、1 個環丙基及 1 個 CF_3 組成之群之取代基取代；或

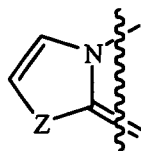
R^4 為苯基、萘基或 5 或 6 員雜芳環，各自視情況經 1 或 2 個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰基、 $C(O)N-(CH_2Z^2CH_2)-$ 、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 $S(O)_2R^{13}$ 、 C_1 - C_4 烷基胺基及 C_2 - C_6 二烷基胺基；或

R^3 及 R^4 與相鄰連接之氮及碳原子一起形成視情況經取代之環 R-1



R-1

或環 R-2



R-2 ;

Z 為 $C(R^8)=C(R^8)$ 、S、O 或 NCH_3 ；

R^5 各自獨立地為 H、F、Cl、氰基或 C_1 - C_4 烷基；

R^6 各自獨立地為 H、F、Cl 或 CH_3 ；

Q 為

群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_4 鹵烷基羰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_2-C_4 烷基胺基羰基、 C_3-C_7 二烷基胺基羰基、 $C(O)N$ — $(-CH_2Z^2CH_2-)$ —、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 $S(O)_2R^{13}$ 、 C_1-C_4 烷基胺基及 C_2-C_6 二烷基胺基；

R^{9b} 各自獨立地為H、鹵素、氰基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 鹵烷氧基；或苯基或吡啶基，各自視情況經1或2個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 $S(O)_nR^{12}$ 及 $S(O)_2R^{13}$ ；

R^{10} 各自獨立地為 $Si(R^{11})_3$ ；或苯基或吡啶基，各自視情況經1至3個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 SF_5 、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_4 鹵烷基羰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_2-C_4 烷基胺基羰基、 C_3-C_7 二烷基胺基羰基、 $C(O)N$ — $(-CH_2Z^2CH_2-)$ —、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 $S(O)_2R^{13}$ 、 C_1-C_4 烷基胺基及 C_2-C_6 二烷基胺基；

R^{11} 各自獨立地為 C_1-C_4 烷基；

R^{12} 各自獨立地為 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 鹵烷基；

R^{13} 各自獨立地為 C_1-C_4 烷基胺基、 C_2-C_6 二烷基胺基或
 $-N(-CH_2Z^2CH_2)-$ ；

R^{14} 為 H、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_5 烷氧基羰基、
 C_2-C_5 烷基胺基羰基、 C_3-C_7 二烷基胺基羰基、 $C(O)N$
 $(-CH_2Z^2CH_2)-$ 、 $S(O)_nR^{12}$ 或 $S(O)_2R^{13}$ ；或苯基或吡啶
 基，各自視情況經 1 至 3 個獨立選自由以下各基組成之
 群之取代基取代：鹵素、氰基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷
 氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 $S(O)_nR^{12}$ 及 $S(O)_2R^{13}$ ；

R^{15} 各自獨立地為 C_1-C_4 烷基；

R^{16} 各自獨立地為 H 或 C_1-C_4 烷基；

R^{17} 各自獨立地為 H、F 或 CH_3 ；

R^{18} 為 H、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_3-C_6 環烷基、 C_1-C_6
 烷氧基、 C_1-C_6 烷基胺基或 C_2-C_7 二烷基胺基；或苯基
 或 5 或 6 員雜芳環，各自視情況經 1 至 3 個獨立選自由以
 下各基組成之群之取代基取代：鹵素、 C_1-C_4 烷基、
 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 $S(O)_nR^{12}$ 及 $S(O)_2R^{13}$ ；

R^{18a} 為苯基或 5 或 6 員雜芳環，各自視情況經 1 至 3 個獨立選
 自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、 C_1-C_4 烷
 基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 $S(O)_nR^{12}$ 及
 $S(O)_2R^{13}$ ；

R^{19} 各自獨立地為 C_1-C_4 烷基；

R^{20} 各自獨立地為 H 或 C_1-C_4 烷基；

R^{21} 各自獨立地為 H 或 C_1-C_4 烷基；

R^{22} 各自獨立地為 H、 C_1-C_4 烷基、 C_3-C_6 環烷基、 C_1-C_4 鹵烷

基、氰基、硝基、C₂-C₅烷氧基羰基、C₂-C₅烷基羰基、C₂-C₅烷基胺基羰基、C₃-C₇二烷基胺基羰基、C(O)N-(—CH₂Z²CH₂—)、S(O)_nR¹²或S(O)₂R¹³；

R²³為H、C₁-C₆烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₃-C₆烯基、C₃-C₆鹵烯基、C₃-C₆炔基、C₃-C₆鹵炔基或CH₂CO₂R²¹；或

R²³為C₃-C₆環烷基或C₄-C₇環烷基烷基，各自視情況經1至4個獨立選自由鹵素、C₁-C₂烷基、1個環丙基及1個CF₃組成之群之取代基取代；或

R²³為苯基或5或6員雜芳環，各自視情況經1至3個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、C₁-C₄烷基、C₂-C₄烯基、C₂-C₄炔基、C₁-C₄鹵烷基、C₂-C₄烷基羰基、C₂-C₄鹵烷基羰基、C₂-C₄烷氧基羰基、C₂-C₄烷基胺基羰基、C₃-C₇二烷基胺基羰基、C(O)N-(—CH₂Z²CH₂—)、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₂-C₆烷氧基烷基、S(O)_nR¹²、S(O)₂R¹³、C₁-C₄烷基胺基及C₂-C₆二烷基胺基；

R²⁴各自獨立地為H、F或CH₃；

m為0、1、2或3；

n各自獨立地為0、1或2；

p為0、1、2、3或4；

q各自獨立地為0、1或2；

y為1或2；且

Z²各自獨立地為CH₂CH₂、CH₂CH₂CH₂或CH₂OCH₂。

如上所述，本發明亦係針對該等式1化合物(包括所有幾

何及立體異構體)及含有其之組合物及其用於控制無脊椎害蟲之用途，且此外在本文中，限制條件為(a)當 R^2 為 $CH_2CH=CH_2$ ， R^3 與 R^4 一起形成環R-2，Z為 $CH=CH$ ，X為O且Y為O時， R^1 不為H、 $CH(CH_3)_2$ 、 $CH_2CH_2CH_2CH_3$ 、 $CH_2CH=CH_2$ 或未經取代之苯基；(b)當 R^1 為H， R^3 與 R^4 一起形成環R-2，Z為 $CH=CH$ ，X為O且Y為O時， R^2 不為 $CH_2CH=CH_2$ 或 $CH_2C\equiv CH$ ；(c)當 R^1 為 CH_2CH_3 ， R^3 與 R^4 一起形成環R-2，Z為 $CH=CH$ ，X為O且Y為O時， R^2 不為 $CH_2(CH_2)_3CH_3$ ；(d)當 R^3 為H， R^2 與 R^4 均為環己基，X為O且Y為O時， R^1 不為 CH_3 ；(e)當 R^1 為H或 C_1-C_3 正烷基， R^3 與 R^4 一起形成環R-2，Z為S，X為O且Y為O時， R^2 不為 C_1-C_6 烷基或 C_3-C_4 烷氧基烷基；(f)當 R^2 為環丙基甲基， R^3 與 R^4 一起形成環R-2，Z為S，X為O且Y為O時， R^1 不為 CH_3 、 CH_2CH_3 或 $CH_2CH_2CH_3$ ；(g)當 R^1 為未經取代之苯基， R^3 及 R^4 一起形成環R-2，Z為S，X為O且Y為O時， R^2 不為 C_3-C_4 烷氧基烷基；及(h)當 R^1 為Br， R^3 與 R^4 一起形成環R-2，Z為S，X為O且Y為O時， R^2 不為 CH_2CH_3 。

本發明亦提供一種組合物，其包含式1化合物及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑及液體稀釋劑組成之群之其他組份。在一實施例中，本發明亦提供一種用於控制無脊椎害蟲之組合物，其包含式1化合物(亦即，生物學有效量)及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑及液體稀釋劑組成之群之其他組份，該組合物視情況進一步包含至少一種其他生物學活性化合物或藥劑(亦即，生物學有

效量)。

本發明進一步提供一種用於保護動物免遭無脊椎寄生害蟲侵襲之組合物，其包含殺寄生蟲有效量之式1化合物(亦即，殺寄生蟲有效量)及至少一種載劑。

本發明進一步提供一種用於控制無脊椎害蟲之噴霧組合物，其包含式1化合物或上述組合物(亦即，生物學有效量)及推進劑。本發明亦提供一種用於控制無脊椎害蟲之誘餌組合物，其包含式1化合物或以上實施例中所述之組合物(亦即，生物學有效量)、一或多種食物材料、視情況之引誘劑及視情況之保濕劑。

本發明進一步提供一種用於控制無脊椎害蟲之陷阱裝置，其包含該誘餌組合物及適合於收納該誘餌組合物之外殼，其中該外殼具有至少一個開口，該開口之尺寸訂定為允許無脊椎害蟲通過開口，因此無脊椎害蟲可自外殼外部之位置接近該誘餌組合物，且其中外殼進一步適合於置放在無脊椎害蟲之潛在或已知活動地點或其附近。

本發明提供一種用於控制無脊椎害蟲之方法，其包含使無脊椎害蟲或其環境與生物學有效量之式1化合物(例如，呈本文所述之組合物形式)接觸。本發明亦係關於該方法，其中使該無脊椎害蟲或其環境與包含生物學有效量之式1化合物及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑及液體稀釋劑組成之群之其他組份的組合物接觸，該組合物視情況進一步包含生物學有效量之至少一種其他生物學活性化合物或藥劑。

本發明亦提供一種保護種子免遭無脊椎害蟲侵襲之方法，其包含使該種子與生物學有效量之式1化合物(例如，呈本文所述之組合物形式)接觸。本發明亦係關於經處理之種子。

本發明進一步提供一種用於處理、預防、抑制及/或殺死體外及/或體內寄生蟲之方法，其包含向動物投與及/或在其上投與殺寄生蟲有效量之式1化合物(例如，呈本文所述之組合物形式)。本發明亦係關於該方法，其中向動物居住之環境(例如，畜舍或氈墊)投與殺寄生蟲有效量之式1化合物(例如，呈本文所述之組合物形式)。

【實施方式】

如本文所用之術語「包含」、「包括」、「具有」、「含有」或其任何其他變體意欲涵蓋非排他性包括。舉例而言，包含一系列要素之組合物、混合物、過程、方法、物件或設備不必僅限於彼等要素，亦可包括其他未明確列出或該組合物、混合物、過程、方法、物件或設備所固有之其他要素。此外，除非明確說明與此相反，否則「或」係指包括性或而非排他性或。舉例而言，條件A或B滿足以下任一種情形：A真(或存在)且B假(或不存在)，A假(或不存在)且B真(或存在)及A與B均真(或存在)。

同樣，本發明之要素或組份前的不定冠詞「一」意欲關於該要素或組份之存在(亦即，出現)之數目為非限制性的。因此，應理解「一」包括一或至少一，且除非數目明顯意指單數，否則要素或組份之單數形式亦包括複數。

如本揭示案中所提及，術語「無脊椎害蟲」包括作為害蟲之有經濟價值之節肢動物、腹足動物及線蟲。術語「節肢動物」包括昆蟲、蟎、蜘蛛、蠍子、蜈蚣、千足蟲(millipede)、潮蟲及綜合蟲類(symphylan)。術語「腹足動物」包括蝸牛、蛞蝓及其他柄眼目。術語「線蟲」包括所有蠕蟲，諸如：蛔蟲、犬惡絲蟲及植食性線蟲(線蟲綱(Nematoda))、吸蟲(吸蟲綱(Trematoda))、棘頭蟲及條蟲(條蟲綱(Cestoda))。

在本揭示案之上下文中，「無脊椎害蟲控制」意謂對無脊椎害蟲發展之抑制(包括致死、減少攝食及/或干擾交配)，且相關表述係類似定義。

術語「農藝」係指諸如用作食物及纖維之農作物的生產，且包括玉米、大豆及其他豆科植物、水稻、穀物(例如，小麥、燕麥、大麥、裸麥、水稻、玉米)、葉類蔬菜(例如，萵苣、甘藍及其他油菜作物)、果類蔬菜(例如，番茄、胡椒、茄子、十字花科植物及葫蘆)、馬鈴薯、甘薯、葡萄、棉花、木本果(例如，梨果、果核及柑橘)、小果(漿果、櫻桃)及其他特種作物(例如，芥菜(canola)、向日葵、橄欖)之種植。

術語「非農藝」係指除農作物以外，諸如園藝作物(例如，並非生長於田野中之溫室、苗圃或觀賞植物)、住宅、農業、商業及工業結構、草皮(例如，草農場、牧草、高爾夫球場、草地、體育場等)、木材產品、儲存產品、農林及植被管理、公共健康(亦即，人類)及動物健康

(例如，諸如寵物、家畜及家禽之家養動物、諸如野生動物之非家養動物)應用。

非農藝應用包括藉由向有待保護之動物投與殺寄生蟲有效(亦即，生物學有效)量之通常呈經調配以用於獸醫學用途之組合物形式的本發明化合物來保護動物免遭無脊椎寄生害蟲侵襲。如本揭示案及申請專利範圍中所提及，術語「殺寄生蟲」係指針對無脊椎寄生害蟲以保護動物免遭該害蟲侵襲之可觀測作用。殺寄生物作用通常與減少目標無脊椎寄生害蟲之出現或活性有關。針對害蟲之該等作用包括壞死、死亡、生長阻滯、活動性降低或保留在宿主動物上或宿主動物中的能力減小、進食減少及繁殖受到抑制。針對無脊椎寄生害蟲之此等作用提供對動物之寄生蟲感染或感染的控制(包括預防、減少或消除)。

在以上敘述中，單獨或在諸如「鹵烷基」之複合詞中使用的術語「烷基」包括直鏈或分支鏈烷基，諸如甲基、乙基、正丙基、異丙基或不同丁基、戊基或己基異構體。「烯基」包括直鏈或分支鏈烯烴，諸如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基及不同丁烯基、戊烯基及己烯基異構體。「烯基」亦包括多烯，諸如1,2-丙二烯基及2,4-己二烯基。「炔基」包括直鏈或分支鏈炔，諸如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基及不同丁炔基、戊炔基及己炔基異構體。「炔基」亦可包括包含多個參鍵之部分，諸如2,5-己二炔基。

「烷氧基」包括(例如)甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異

丙氧基及不同丁氧基、戊氧基及己氧基異構體。「烷氧基烷基」表示烷基上之烷氧基取代。「烷氧基烷基」之實例包括 CH_2OCH_3 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 及 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 。

「環烷基」包括(例如)環丙基、環丁基、環戊基及環己基。術語「環烷基烷基」表示烷基部分上之環烷基取代。「環烷基烷基」之實例包括環丙基甲基、環戊基乙基及與直鏈或分支鏈烷基鍵結之其他環烷基部分。

單獨或在諸如「鹵烷基」之複合詞中或在諸如「經鹵素取代之烷基」之描述中使用的術語「鹵素」包括氟、氯、溴或碘。此外，當在諸如「鹵烷基」之複合詞中使用或在諸如「經鹵素取代之烷基」之描述中使用時，該烷基可能相同或不同之鹵素原子部分或完全取代。「鹵烷基」或「經鹵素取代之烷基」之實例包括 CF_3 、 CH_2Cl 、 CH_2CF_3 及 CCl_2CF_3 。術語「鹵烷氧基」、「鹵烯基」、「鹵炔基」及其類似基團係類似於術語「鹵烷基」定義。「鹵烷氧基」之實例包括 OCF_3 、 OCH_2CCl_3 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CHF}_2$ 及 OCH_2CF_3 。「鹵烯基」之實例包括 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{Cl})_2$ 及 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CF}_3$ 。「鹵炔基」之實例包括 $\text{CHClC}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{C}\equiv\text{CCF}_3$ 、 $\text{C}\equiv\text{CCCl}_3$ 及 $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{F}$ 。

「烷基胺基」表示經直鏈或分支鏈烷基取代之NH基團。「烷基胺基」之實例包括 NHCH_2CH_3 、 $\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 及 $\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 。「二烷基胺基」表示經2個直鏈或分支鏈烷基獨立取代之N基團。「二烷基胺基」之實例包括

$N(CH_3)_2$ 、 $N(CH_3CH_2CH_2)_2$ 及 $N(CH_3)CH_2CH_3$ 。「鹵二烷基胺基」表示與N基團鍵結之一直鏈或分支鏈烷基部分及一直鏈或分支鏈鹵烷基部分或與N基團鍵結之2個獨立直鏈或分支鏈鹵烷基部分，其中「鹵烷基」係如上所定義。「鹵二烷基胺基」之實例包括 $N(CH_2CH_3)(CH_2CH_2Cl)$ 及 $N(CF_2CF_3)_2$ 。

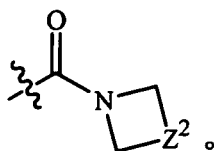
「烷基羰基」表示與C(O)部分鍵結之直鏈或分支鏈烷基部分。如本文所用之化學縮寫C(O)及C(=O)表示羰基部分。「烷基羰基」之實例包括 $C(O)CH_3$ 、 $C(O)CH_2CH_2CH_3$ 及 $C(O)CH(CH_3)_2$ 。「鹵烷基羰基」之實例包括 $C(O)CF_3$ 、 $C(O)CCl_3$ 、 $C(O)CH_2CF_3$ 及 $C(O)CF_2CF_3$ 。

「烷氧基羰基」表示與CO₂部分鍵結之直鏈或分支鏈烷基部分。如本文所用之化學縮寫CO₂及C(O)O表示酯部分。「烷氧基羰基」之實例包括 $C(O)OCH_3$ 、 $C(O)OCH_2CH_3$ 、 $C(O)OCH_2CH_2CH_3$ 及 $C(O)OCH(CH_3)_2$ 。

「烷基胺基羰基」表示與C(O)NH部分鍵結之直鏈或分支鏈烷基部分。如本文所用之化學縮寫C(O)NH及C(O)N表示醯胺部分(亦即，胺基羰基)。「烷基胺基羰基」之實例包括 $C(O)NHCH_3$ 、 $C(O)NHCH_2CH_2CH_3$ 及 $C(O)NHCH(CH_3)_2$ 。

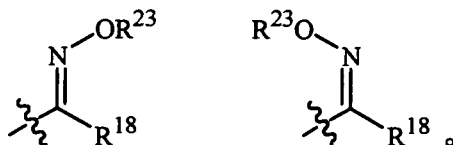
「二烷基胺基羰基」表示與C(O)N部分鍵結之2個獨立直鏈或分支鏈烷基部分。「二烷基胺基羰基」之實例包括 $C(O)N(CH_3)_2$ 及 $C(O)N(CH_3)(CH_2CH_3)$ 。

如本文所用之化學縮寫 $C(O)N-(CH_2Z^2CH_2)-$ 表示二烷基胺基羰基部分，其中2個烷基相連以形成如下所示之環



化學縮寫 $N-(CH_2Z^2CH_2)-$ 係類似定義。

如本文所用之化學縮寫 $C(=NOR^{23})R^{18}$ 表示如下所示之脞部分之兩個幾何異構體



以上結構及本揭示案中其他地方(例如, 表1前之X-24至X-128及Y-30至Y-71)之波形線表示分子片段與分子其餘部分連接之位置。

取代基中碳原子總數由「 C_i-C_j 」字首指示, 其中*i*及*j*為1至7之數字。舉例而言, C_1-C_4 烷基表示甲基至丁基; C_2 烷氧基烷基表示 CH_2OCH_3 ; C_3 烷氧基烷基表示(例如) $CH_3CH(OCH_3)$ 、 $CH_2CH_2OCH_3$ 或 $CH_2OCH_2CH_3$; 且 C_4 烷氧基烷基表示含有總共四個碳原子之經烷氧基取代之烷基的各種異構體, 實例包括 $CH_2OCH_2CH_2CH_3$ 及 $CH_2CH_2OCH_2CH_3$ 。

當化合物經取代基(其帶有表示該等取代基的數目可超過1之下標)取代時, 該等取代基(當其超過1時)係獨立選自規定取代基之群, 例如 $(R^7)_p$, *p*為0、1、2、3或4。當基團含有可為氫之取代基(例如, R^1 或 R^3)時, 因而當此取代基為氫時, 應認識到此等於該基團未經取代。當顯示可變基團視情況連接至一位置時, 例如列表1之U-36中之 $(R^v)_r$ (其

中 r 可為0)，即使可變基團定義中未敘述，氫亦可位於該位置上。當基團上之一或多個位置稱之為「未經取代」時，連接氫原子以佔據任何空化合價。

術語「雜芳環」表示其中至少一個形成環主鏈之原子不為碳，例如為氮、氧或硫之芳環。通常雜芳環含有至多4個氮、至多1個氧及至多1個硫。除非另外指示，否則雜芳環可經由任何可用碳或氮藉由置換該碳或氮上之氫來連接。「芳族」表示每一環原子基本上在同一平面上且具有垂直於環平面之 p 軌道，且其中 $(4n+2)$ 個 π 電子(其中 n 為正整數)與環締合以遵守休克爾規則(Hückel's rule)。術語「雜芳族雙環環系統」表示由2個稠環組成之環系統，其中2個環中之至少一者為如上定義之雜芳環。

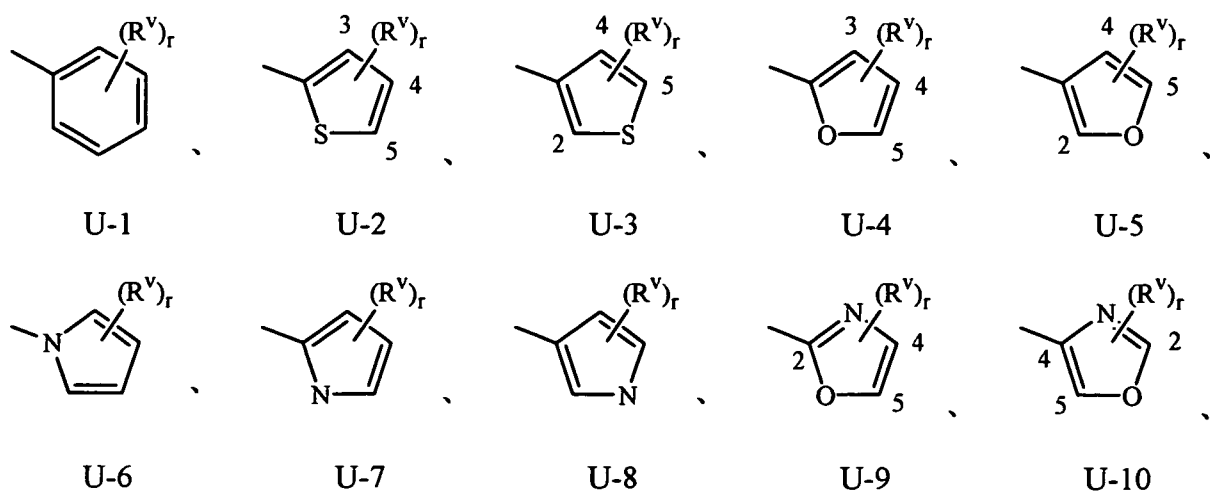
當基團(例如， R^1 定義中之環烷基)視情況經指定取代基數目(例如，「1至4個」)的所列取代基取代時，該基團可能未經取代或經數目在至多所指定之大數字(例如，「4」)範圍內的取代基取代，且所連接之取代基係獨立選自所列取代基。當取代基清單包括針對特定取代基之下限(例如，1個環丙基)時，此相應限制該特定取代基在連接至該基團之取代基中存在之數目。因此，關於 R^1 ，雖然至多四個取代基可連接至環烷基，但該等取代基中僅一者可為環丙基。

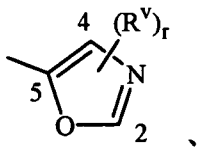
除非另外描述，否則當取代基(例如， R^1)為5或6員含氮雜芳環時，其可經由任何可用碳或氮環原子連接至式1之其餘部分。如上所述，諸如 R^1 之取代基可為(尤其)視情況

經1至3個選自如發明內容中所定義之取代基之群的取代基取代之苯基。視情況經1至3個取代基取代之苯基的一實例為列表1中例示為U-1之環，其中 R^v 係如發明內容中定義(例如，針對 R^1)且 r 為0至3之整數。

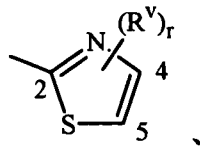
如上所述，諸如 R^1 之取代基可為(尤其)視情況經一或多個選自如發明內容中所定義之取代基之群的取代基取代之5或6員雜芳環。視情況經一或多個取代基取代之5或6員雜芳環的實例包括列表1中所示之環U-2至U-61，其中 R^v 為如發明內容中所定義之任何取代基(例如，針對 R^1)，且 r 為0至2之整數，受各U基團上可用位置之數目限制。因為U-29、U-30、U-36、U-37、U-38、U-39、U-40、U-41、U-42及U-43僅具有一個可用位置，所以對於此等U基團而言， r 限於0或1之整數，且 r 為0意謂該U基團未經取代且氫存在於由 $(R^v)_r$ 指示之位置。

列表1

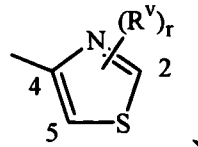




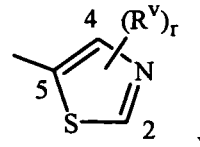
U-11



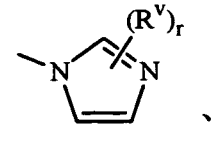
U-12



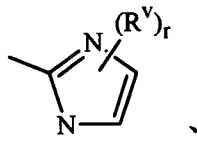
U-13



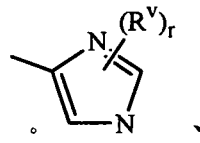
U-14



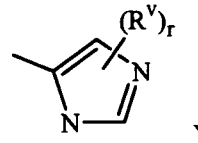
U-15



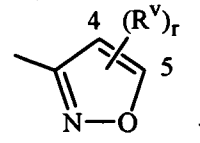
U-16



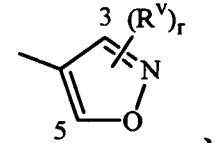
U-17



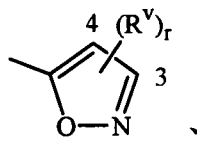
U-18



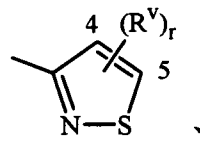
U-19



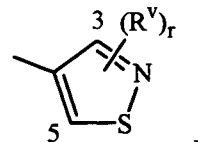
U-20



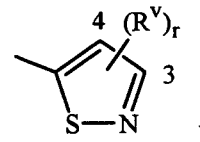
U-21



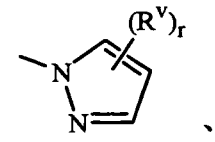
U-22



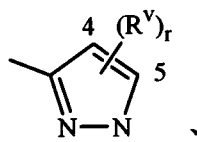
U-23



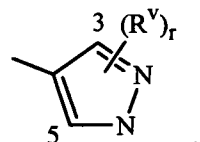
U-24



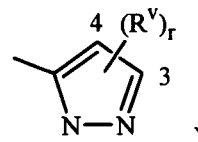
U-25



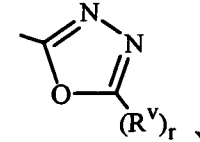
U-26



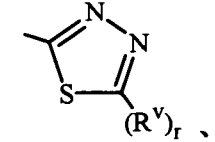
U-27



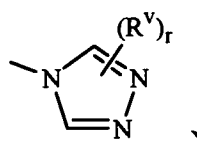
U-28



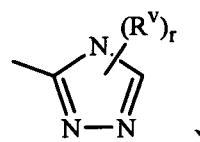
U-29



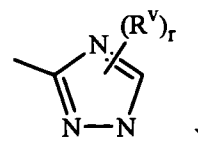
U-30



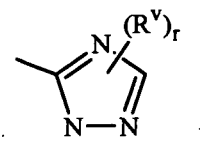
U-31



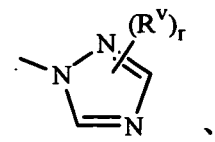
U-32



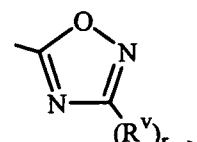
U-33



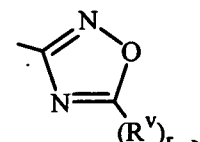
U-34



U-35



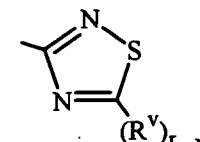
U-36



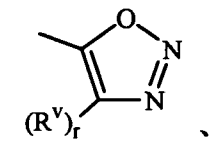
U-37



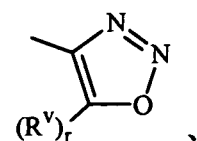
U-38



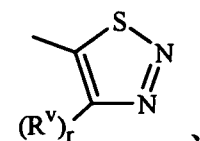
U-39



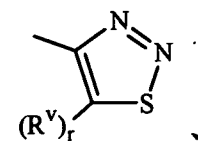
U-40



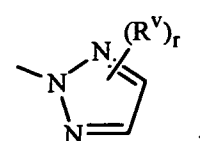
U-41



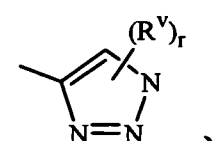
U-42



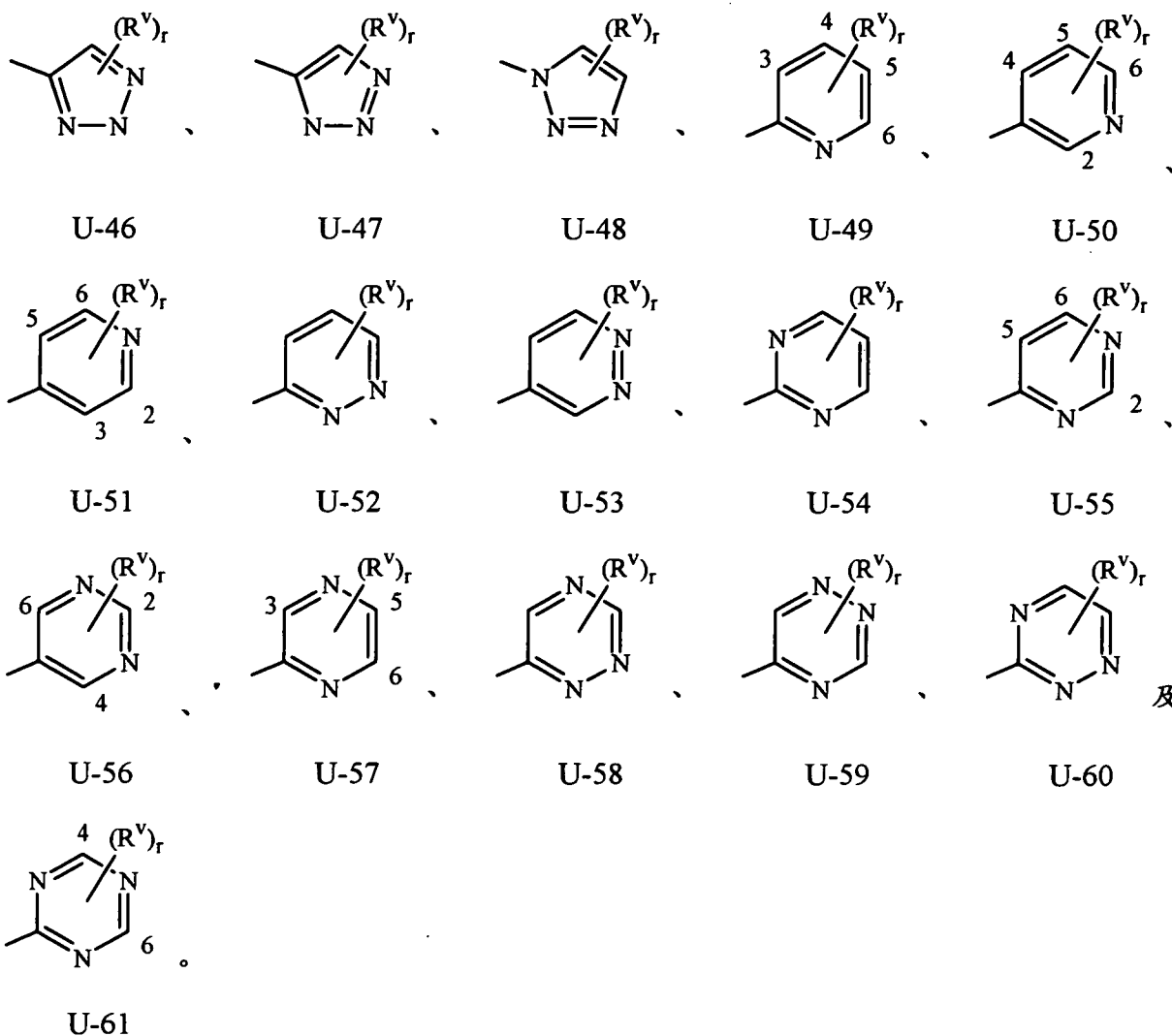
U-43



U-44



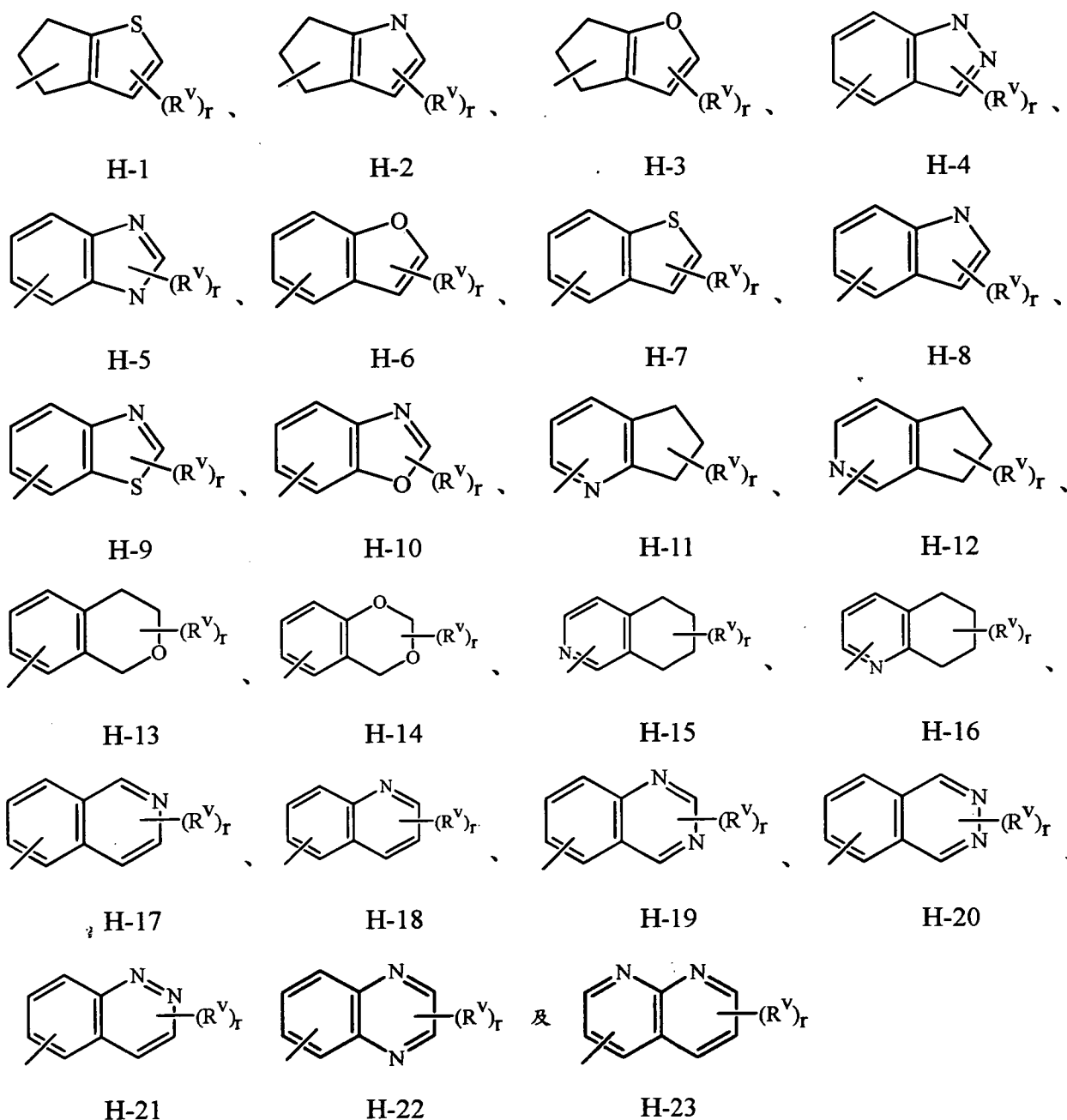
U-45



如上所述，諸如 R^1 之取代基可為(尤其)視情況經至多 3 個選自如發明內容中所定義之取代基之群的取代基取代之 8、9 或 10 員雜芳族雙環環系統。視情況經至多 3 個取代基取代之 8、9 或 10 員雜芳族雙環環系統的實例包括列表 2 中所示之環系統 H-1 至 H-23，其中 R^v 為如發明內容中定義之任何取代基(例如碳環成員上之鹵素、氰基、硝基、 SF_5 、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 C_1 - C_4 烷基胺基

及C₂-C₆二烷基胺基及氮環成員上之甲基)且r為0至3之整數，受各H基團上可用位置之數目限制。

列表2

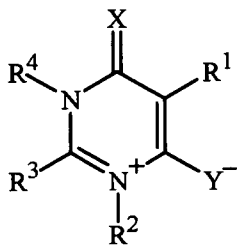


雖然結構U-1至U-61及H-1至H-23中展示R^v基團，但應注意該等基團並非必須存在，因為其為可選取代基。需要取代以填滿其價數之氮原子經H或R^v取代。注意當介於(R^v)_r與U或H基團之間的連接點例示為不固定時，(R^v)_r可連接

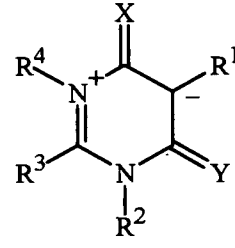
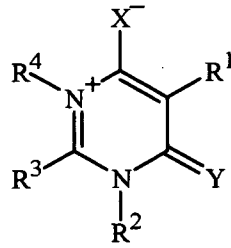
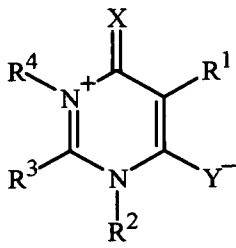
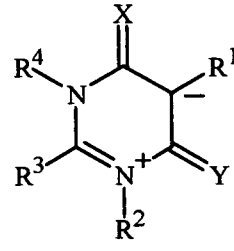
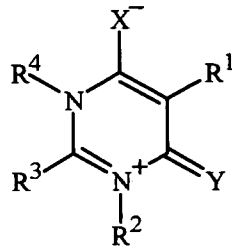
至該U或H基團之任何可用碳原子或氮原子上。注意當U或H基團上之連接點例示為不固定時，U或H基團可經由U或H基團之任何可用碳或氮藉由置換氫原子連接至式1之其餘部分。注意一些U基團僅可經2個以下R^v基團取代(例如，U-2至U-5、U-7至U-48及U-52至U-61)。

在此項技術中已知多種合成方法能夠製備芳族及非芳族雜環及環系統；關於廣泛評述參見 *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky及C. W. Rees主編，Pergamon Press, Oxford, 1984之八卷組及 *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, A. R. Katritzky、C. W. Rees及E. F. V. Scriven主編，Pergamon Press, Oxford, 1996之十二卷組。

式1化合物為中離子內鹽。「內鹽」在此項技術中亦稱為「兩性離子」，雖然其為電中性分子，但根據價鍵理論其各價鍵結構中之不同原子上攜帶形式正電荷及負電荷。此外，式1化合物之分子結構可由下文所示之六個價鍵結構表示，各價鍵結構將形式正電荷及負電荷置於不同原子上。因為此共振，所以式1化合物亦描述為「中離子」。雖然出於簡明起見，在本揭示案及申請專利範圍中將式1之分子結構描述為單一價鍵結構，但應瞭解此特定價鍵結構為與式1化合物之分子鍵結有關之所有六個價鍵結構的代表性實例。因此，除非另外說明，否則在本揭示案及申請專利範圍中提及式1係關於所有六個可應用之價鍵結構及其他(例如，分子軌道理論)結構。



1



本發明之化合物可以一或多種立體異構體之形式存在。多種立體異構體包括對映異構體、非對映異構體、滯轉異構體及幾何異構體。舉例而言，取代基及其他分子組份(諸如， R^1)可含有對掌中心。熟習此項技術者應瞭解，一種立體異構體當相對於其他立體異構體富集時或當與其他立體異構體分離時可更具活性及/或可展示有益作用。此外，熟習此項技術者已知如何分離、富集及/或選擇性製備該等立體異構體。本發明包含外消旋混合物以及在此等對掌性中心上之富集及基本上純的立體構型。

由於空間位阻引起有限鍵旋轉，所以本發明之化合物可以一或多種構形異構體之形式存在。舉例而言，由於繞 R^1 -嘓啉鎗環鍵有限旋轉，所以 R^1 為在鄰位經空間需要之烷基(例如，異丙基)取代之苯基的式1化合物可以2種旋轉異構體之形式存在。本發明包含構形異構體之混合物。此外，本發明包括一種構象異構體相對於其他構象異構體富

集之化合物。

式1化合物可以多晶型物形式(亦即,不同結晶形式)以固相存在。術語「多晶型物」係指化合物之特定結晶形式,其可以不同結晶形式結晶,此等形式在晶格中具有不同分子排列及/或構形。雖然多晶型物可具有相同化學組成,但其亦可因共結晶水或其他分子(其在晶格中結合較弱或較強)之存在或缺乏而組成不同。多晶型物可在諸如晶體形狀、密度、硬度、顏色、化學穩定性、熔點、吸濕性、懸浮性、溶解速率及生物可用性之化學、物理及生物性質上不同。熟習此項技術者將瞭解式1化合物之多晶型物可相對於同一式1化合物之另一多晶型物或多晶型物混合物展示有益作用(例如,適於製備適用調配物)。式1化合物之特定多晶型物之製備及分離可藉由熟習此項技術者已知之方法,包括(例如)使用所選溶劑及溫度進行結晶來實現。本發明包含個別多晶型物與多晶型物混合物兩者,包括一種多晶型物相對於其他多晶型物富集之混合物。

如發明內容所述之本發明之實施例包括下文所述之彼等實施例。除非實施例中進一步定義,否則在以下實施例中,提及「式1化合物」包括發明內容中指定之取代基之定義。式1r及1s之化合物為式1之多種子集。

實施例1.式1化合物,其中X為O或NR²²。

實施例2.實施例1之化合物,其中X為O。

實施例3.實施例1之化合物,其中X為NR²²。

實施例4.式1化合物,其中X為S。

實施例5.式1化合物或實施例1-4中任一者之化合物，其中Y為O或NR²²。

實施例6.實施例5之化合物，其中Y為O。

實施例7.實施例5之化合物，其中Y為NR²²。

實施例8.式1化合物或實施例1-4中任一者之化合物，其中Y為S。

實施例9.式1化合物或實施例1-8中任一者之化合物，其中R¹為H或鹵素。

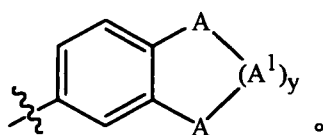
實施例10.式1化合物或實施例1-8中任一者之化合物，其中R¹為苯基或6員雜芳環，各自視情況經1至3個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、C₁-C₄烷基、C₂-C₄烯基、C₂-C₄炔基、C₁-C₄鹵烷基、C₂-C₄鹵烯基、C₂-C₄烷基羰基、C₂-C₄鹵烷基羰基、C₂-C₄烷氧基羰基、C₂-C₄烷基胺基羰基、C₃-C₇二烷基胺基羰基、C(O)N(-CH₂Z²CH₂-)、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₂-C₆烷氧基烷基、S(O)_nR¹²、S(O)₂R¹³、C₁-C₄烷基胺基、C₂-C₆二烷基胺基、SF₅、Si(CH₃)₃、CHO、羥基、OC(O)R¹⁹及N(R²⁰)C(O)R¹⁹。

實施例11.實施例10之化合物，其中R¹為苯基或吡啶基，各自視情況經1至3個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、C₁-C₄烷基、C₂-C₄烯基、C₂-C₄炔基、C₁-C₄鹵烷基、C₂-C₄鹵烯基、C₂-C₄烷基羰基、C₂-C₄鹵烷基羰基、C₂-C₄烷氧基羰基、C₂-C₄烷基胺基羰基、C₃-C₇二烷基胺

基羰基、 $C(O)N(-CH_2Z^2CH_2-)$ 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 $S(O)_2R^{13}$ 、 C_1-C_4 烷基胺基、 C_2-C_6 二烷基胺基、 SF_5 、 $Si(CH_3)_3$ 、 CHO 、羥基、 $OC(O)R^{19}$ 及 $N(R^{20})C(O)R^{19}$ 。

實施例 12. 實施例 11 之化合物，其中 R^1 為苯基或吡啶基，各自視情況經 1 至 3 個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_2-C_4 烷基胺基羰基、 C_3-C_7 二烷基胺基羰基、 $C(O)N(-CH_2Z^2CH_2-)$ 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 及 $S(O)_2R^{13}$ 。

實施例 13. 式 1 化合物或實施例 1-8 中任一者之化合物，其中 R^1 為



實施例 14. 式 1 化合物或實施例 1-8 中任一者之化合物，其中 R^1 為 $C(X^1)R^{18}$ 或 $C(=NOR^{23})R^{18}$ 。

實施例 15. 實施例 14 之化合物，其中 R^1 為 $C(X^1)R^{18}$ 。

實施例 15a. 式 1 化合物或實施例 1-15 中任一者之化合物，其中 X^1 為 O。

實施例 15b. 式 1 化合物或實施例 1-15 中任一者之化合物，其中 X^1 為 S。

實施例 16. 實施例 14 之化合物，其中 R^1 為 $C(=NOR^{23})R^{18}$ 。

實施例 17. 式 1 化合物或實施例 1-8 中任一者之化合物，其中 R^1 為 8 至 10 員雜芳族雙環環系統，其視情況在碳環成員上經至多 3 個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氟基、硝基、 SF_5 、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_4 鹵烷基羰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_2-C_4 烷基胺基羰基、 C_3-C_7 二烷基胺基羰基、 $C(O)N-(CH_2Z^2CH_2)-$ 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 $S(O)_2R^{13}$ 、 C_1-C_4 烷基胺基、 C_2-C_6 二烷基胺基、 $Si(CH_3)_3$ 、 CHO 、羥基、 $OC(O)R^{19}$ 及 $N(R^{20})C(O)R^{19}$ ，且視情況在氮環成員上經甲基取代。

實施例 18. 式 1 化合物或實施例 1-8 中任一者之化合物，其中 R^1 為苯基或 5 或 6 員雜芳環，各自經 GQ^1 取代且視情況進一步經 1 或 2 個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氟基、硝基、 SF_5 、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_4 鹵烷基羰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_2-C_4 烷基胺基羰基、 C_3-C_7 二烷基胺基羰基、 $C(O)N-(CH_2Z^2CH_2)-$ 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 $S(O)_2R^{13}$ 、 C_1-C_4 烷基胺基、 C_2-C_6 二烷基胺基、 $Si(CH_3)_3$ 、 CHO 、羥基、 $OC(O)R^{19}$ 及 $N(R^{20})C(O)R^{19}$ 。

實施例 19. 實施例 18 之化合物，其中 R^1 為苯基或吡啶基，各自經 GQ^1 取代且視情況進一步經 1 或 2 個獨立

選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、 SF_5 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷氧基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基胺基羰基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 二烷基胺基羰基、 $\text{C}(\text{O})\text{N}-(\text{---CH}_2\text{Z}^2\text{CH}_2\text{---})$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷氧基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 烷氧基烷基、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{12}$ 及 $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{13}$ 。

實施例 19a. 式 1 化合物或實施例 1-19 中任一者之化合物，其中 Q^1 為苯基或吡啶基，各自視情況經 1 至 3 個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷氧基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基胺基羰基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 二烷基胺基羰基、 $\text{C}(\text{O})\text{N}-(\text{---CH}_2\text{Z}^2\text{CH}_2\text{---})$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷氧基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 烷氧基烷基、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{12}$ 及 $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{13}$ 。

實施例 19b. 式 1 化合物或實施例 1-8 中任一者之化合物，其中 R^1 係選自實施例 9、10、13、14 及 17。

實施例 20. 式 1 化合物或實施例 1-19b 中任一者之化合物，其中 R^2 為 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 鹵烷基、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^{21}$ 、 $\text{CR}^5\text{R}^6\text{CH}_2\text{OR}^{21}$ 、 $\text{CR}^5\text{R}^6\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OR}^{21}$ 、 $\text{CR}^5\text{R}^6\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{21}$ 或 $\text{CR}^5\text{R}^6\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{21}$ 。

實施例 21. 式 1 化合物或實施例 1-19b 中任一者之化合物，其中 R^2 為 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 環烷基或 $\text{C}_4\text{-C}_7$ 環烷基烷基，各自視情況經 1 至 4 個選自由鹵素、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基、1 個環丙基及 1 個 CF_3 組成之群之取代基取代。

實施例 22. 式 1 化合物或實施例 1-19b 中任一者之化合

物，其中 R^2 為 CR^5R^6Q 。

實施例 22a. 式 1 化合物或實施例 1-19b 中任一者之化合物，其中 R^2 係選自實施例 20、21 及 22。

實施例 23. 實施例 20 之化合物，其中 R^2 為 C_2-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基或 $CR^5R^6CH_2OR^{21}$ 。

實施例 24. 實施例 21 之化合物，其中 R^2 為視情況經 1 至 4 個選自由鹵素、 C_1-C_2 烷基、1 個環丙基及 1 個 CF_3 組成之群之取代基取代的 C_4-C_7 環烷基烷基。

實施例 24a. 式 1 化合物或實施例 1-19b 中任一者之化合物，其中 R^2 係選自實施例 23 及 24。

實施例 25. 式 1 化合物或實施例 1-24 中任一者之化合物，其中 G 為一直接鍵。

實施例 26. 式 1 化合物或實施例 1-25 中任一者之化合物，其中 R^3 為 H、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_2-C_6 鹵炔基或 $C\equiv CR^{10}$ 。

實施例 27. 式 1 化合物或實施例 1-25 中任一者之化合物，其中 R^3 為 C_3-C_6 環烷基或 C_4-C_7 環烷基烷基，各自視情況經 1 至 4 個獨立選自由鹵素、 C_1-C_2 烷基、1 個環丙基及 1 個 CF_3 組成之群之取代基取代。

實施例 28. 實施例 26 之化合物，其中 R^3 為 C_1-C_6 烷基或 C_1-C_6 鹵烷基。

實施例 29. 實施例 28 之化合物，其中 R^3 為 CH_3 。

實施例 29a. 式 1 化合物或實施例 1-29 中任一者之化合物，其中 R^4 為 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_2-C_6 鹵炔基或

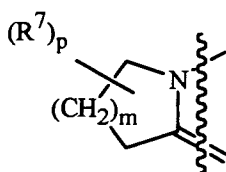


實施例 29b. 式 1 化合物或實施例 1-29 中任一者之化合物，其中 R^4 為 C_3 - C_6 環烷基或 C_4 - C_7 環烷基烷基，各自視情況經 1 至 4 個獨立選自由鹵素、 C_1 - C_2 烷基、1 個環丙基及 1 個 CF_3 組成之群之取代基取代。

實施例 29c. 實施例 29a 之化合物，其中 R^4 為 C_1 - C_6 烷基或 C_1 - C_6 鹵烷基。

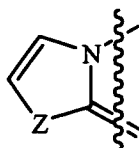
實施例 29d. 實施例 29c 之化合物，其中 R^4 為 CH_3 。

實施例 30. 式 1 化合物或實施例 1-25 中任一者之化合物，其中 R^3 及 R^4 與相鄰連接之氮及碳原子一起形成視情況經取代之環 **R-1**



R-1

或環 **R-2**



R-2 。

實施例 31. 實施例 30 之化合物，其中 R^3 及 R^4 與相鄰連接之氮及碳原子一起形成視情況經取代之環 **R-1**。

實施例 32. 實施例 30 之化合物，其中 R^3 及 R^4 與相鄰連接之氮及碳原子一起形成視情況經取代之環 **R-2**。

實施例 32a. 式 1 化合物或實施例 1-25 中任一者之化合物，其中 R^3 係選自實施例 26 及 27，且 R^4 係選自實施

例 29a 及 29b；或 R^3 及 R^4 與相鄰連接之氮及碳原子一起形成如實施例 30 中所述之視情況經取代之環。

實施例 32b. 式 1 化合物或實施例 1-32a 中任一者之化合物，其中 m 為 2 或 3。

實施例 32c. 式 1 化合物或實施例 1-32b 中任一者之化合物，其中 p 為 0。

實施例 32d. 式 1 化合物或實施例 1-32c 中任一者之化合物，其中 Z 為 $C(R^8)=C(R^8)$ 或 S 。

實施例 33. 實施例 32d 之化合物，其中 Z 為 $CH=CH$ 或 $CH=CF$ ，其中 $CH=CF$ 部分之取向使得與氟鍵結之碳原子與嘧啶鎗環稠合相鄰。

實施例 34. 實施例 32d 之化合物，其中 Z 為 S 。

實施例 35. 式 1 化合物或實施例 1-34 中任一者之化合物，其中 R^5 各自獨立地為 H 或 C_1-C_4 烷基。

實施例 36. 實施例 35 之化合物，其中 R^5 各自獨立地為 H 或甲基。

實施例 37. 式 1 化合物或實施例 1-36 中任一者之化合物，其中 R^6 為 H 。

實施例 38. 式 1 化合物或實施例 1-37 中任一者之化合物，其中 Q 為 $Q-1$ 、 $Q-5$ 、 $Q-6$ 或 $Q-9$ 。

實施例 39. 實施例 38 之化合物，其中 Q 為 $Q-1$ 、 $Q-5$ 或 $Q-9$ 。

實施例 40. 實施例 38 之化合物，其中 Q 為 $Q-1$ 。

實施例 41. 實施例 38 之化合物，其中 Q 為 $Q-5$ 。

實施例 42. 實施例 38 之化合物，其中 Q 為 $Q-6$ 。

實施例43. 實施例38之化合物，其中Q為Q-9。

實施例44. 實施例38、39、41或43中任一者之化合物，
其中Z¹為O。

實施例45. 實施例38、39、41或43中任一者之化合物，
其中Z¹為S。

實施例46. 實施例38、39、41或43中任一者之化合物，
其中Z¹為NR¹⁴。

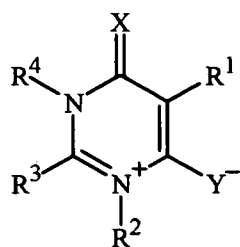
實施例47. 式1化合物或實施例1-46中任一者之化合物，
其中R^{9a}各自獨立地為H、鹵素、氟基、C₁-C₄烷基、
C₁-C₄鹵烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、SF₅
或S(O)_nR¹²；或C₃-C₆環烷基或C₄-C₇環烷基烷基，各
自視情況經1至4個選自由鹵素、C₁-C₂烷基、1個環
丙基及1個CF₃組成之群之取代基取代。

實施例48. 實施例47之化合物，其中R^{9a}各自獨立地為
H、鹵素、氟基、C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵烷基、C₁-C₄
烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、SF₅或S(O)_nR¹²。

實施例49. 實施例47之化合物，其中R^{9a}各自獨立地為C₃-C₆
環烷基或C₄-C₇環烷基烷基，各自視情況經1至4個選
自由鹵素、C₁-C₂烷基、1個環丙基及1個CF₃組成之
群之取代基取代。

實施例50. 式1化合物或實施例1-49中任一者之化合物，
其中R^{9b}各自獨立地為H、鹵素、氟基、C₁-C₄烷基、
C₁-C₄鹵烷基、C₁-C₄烷氧基或C₁-C₄鹵烷氧基。

實施例51. 式1r化合物



1r

其中

X為O或S；

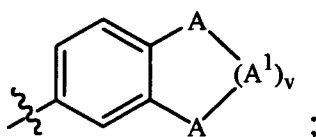
Y為O或S；

R^1 為H、鹵素、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 鹵炔基或 $C\equiv CR^{10}$ ；或

R^1 為 C_3 - C_6 環烷基或 C_4 - C_7 環烷基烷基，各自視情況經1至4個獨立選自由鹵素、 C_1 - C_2 烷基、1個環丙基及1個 CF_3 組成之群之取代基取代；或

R^1 為苯基、萘基或5或6員雜芳環，各自視情況經1至3個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 C_1 - C_4 烷基胺基及 C_2 - C_6 二烷基胺基；或

R^1 為



A各自獨立地為 $C(R^{16})_2$ 、O、S或 NR^{15} ；

A^1 各自獨立地為 $C(R^{17})_2$ ；

R^2 為 C_2 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_3 - C_6 烯基、 C_3 - C_6 鹵烯基、 C_3 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 鹵炔基或 C_2 - C_6 烷氧基烷基；或

R^2 為 C_3 - C_6 環烷基或 C_4 - C_7 環烷基烷基，各自視情況經1至4個選自由鹵素、 C_1 - C_2 烷基、1個環丙基及1個 CF_3 組成之群之取代基取代；或

R^2 為 CR^5R^6Q ；

R^3 為H、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 鹵炔基或 $C\equiv CR^{10}$ ；或

R^3 為 C_3 - C_6 環烷基或 C_4 - C_7 環烷基烷基，各自視情況經1至4個獨立選自由鹵素、 C_1 - C_2 烷基、1個環丙基及1個 CF_3 組成之群之取代基取代；或

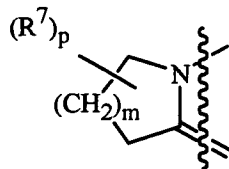
R^3 為苯基、萘基或5或6員雜芳環，各自視情況經1或2個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 C_1 - C_4 烷基胺基及 C_2 - C_6 二烷基胺基；

R^4 為 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 鹵炔基或 $C\equiv CR^{10}$ ；或

R^4 為 C_3 - C_6 環烷基或 C_4 - C_7 環烷基烷基，各自視情況經 1 至 4 個獨立選自由鹵素、 C_1 - C_2 烷基、1 個環丙基及 1 個 CF_3 組成之群之取代基取代；或

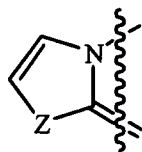
R^4 為苯基、萘基或 5 或 6 員雜芳環，各自視情況經 1 或 2 個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_n R^{12}$ 、 C_1 - C_4 烷基胺基及 C_2 - C_6 二烷基胺基；或

R^3 及 R^4 與相鄰連接之氮及碳原子一起形成視情況經取代之環 **R-1**



R-1

或環 **R-2**



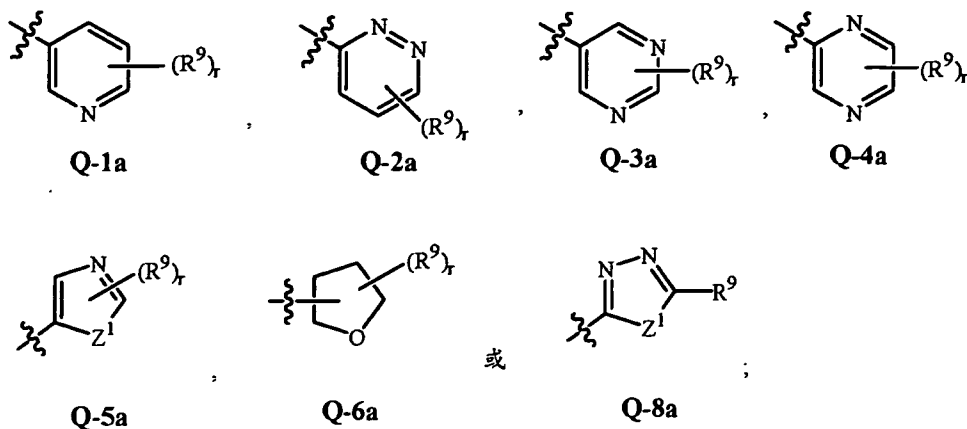
R-2 ;

Z 為 $C(R^8)=C(R^8)$ 或 S ;

R^5 為 H 、 F 、 Cl 、氰基或 C_1 - C_4 烷基；

R^6 為 H 、 F 、 Cl 或 CH_3 ；

Q 為



Z^1 為 O、S 或 NR^{14} ；

R^7 為 H、鹵素、氰基、 CF_3 、 C_1 - C_3 烷基或 C_3 - C_6 環烷基；

R^8 各自獨立地為 H 或 F；

R^9 各自獨立地為 H、鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 鹵烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_2 - C_4 鹵炔基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷氧基羰基、 $C(O)NH_2$ 、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 鹵二烷基胺基羰基或 $S(O)_nR^{12}$ ；或

R^9 各自獨立地為 C_3 - C_6 環烷基或 C_4 - C_7 環烷基烷基，各自視情況經 1 至 4 個選自由鹵素、 C_1 - C_2 烷基、1 個環丙基及 1 個 CF_3 組成之群之取代基取代；或

R^9 各自獨立地為苯基或 5 或 6 員雜芳環，各自視情況經 1 或 2 個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基

基、C₃-C₇二烷基胺基羰基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵
 烷氧基、C₂-C₆烷氧基烷基、S(O)_nR¹²、C₁-C₄烷基胺
 基及C₂-C₆二烷基胺基；

R¹⁰各自獨立地為Si(R¹¹)₃；或視情況經以下各基取代之
 苯基：鹵素、氰基、硝基、C₁-C₄烷基、C₂-C₄烯
 基、C₂-C₄炔基、C₁-C₄鹵烷基、C₂-C₄烷基羰基、
 C₂-C₄鹵烷基羰基、C₂-C₄烷氧基羰基、C₂-C₄烷基胺
 基羰基、C₃-C₇二烷基胺基羰基、C₂-C₆烷氧基烷
 基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、S(O)_nR¹²、C₁-C₄
 烷基胺基或C₂-C₆二烷基胺基；

R¹¹各自獨立地為C₁-C₄烷基；

R¹²各自獨立地為C₁-C₄烷基或C₁-C₄鹵烷基；

R¹⁴為C₁-C₄烷基；

R¹⁵各自獨立地為C₁-C₄烷基；

R¹⁶各自獨立地為H或C₁-C₄烷基；

R¹⁷各自獨立地為H或F；

m為1、2或3；

n各自獨立地為0、1或2；

p為0、1、2、3或4；

r各自獨立地為0、1或2；且

v為1或2；

其限制條件為(a)當R²為CH₂CH=CH₂，R³與R⁴一起形成
 環R-2，Z為CH=CH，X為O且Y為O時，R¹不為H、
 CH(CH₃)₂、CH₂CH₂CH₂CH₃、CH₂CH=CH₂或未經取

代之苯基；(b)當 R^1 為H， R^3 與 R^4 一起形成環R-2，Z為CH=CH，X為O且Y為O時， R^2 不為 $CH_2CH=CH_2$ 或 $CH_2C\equiv CH$ ；(c)當 R^1 為 CH_2CH_3 ， R^3 與 R^4 一起形成環R-2，Z為CH=CH，X為O且Y為O時， R^2 不為 $CH_2(CH_2)_3CH_3$ ；(d)當 R^3 為H， R^2 與 R^4 均為環己基，X為O且Y為O時， R^1 不為 CH_3 ；(e)當 R^1 為H或 C_1-C_3 正烷基， R^3 與 R^4 一起形成環R-2，Z為S，X為O且Y為O時， R^2 不為 C_1-C_6 烷基或 C_3-C_4 烷氧基烷基；(f)當 R^2 為環丙基甲基， R^3 與 R^4 一起形成環R-2，Z為S，X為O且Y為O時， R^1 不為 CH_3 、 CH_2CH_3 或 $CH_2CH_2CH_3$ ；(g)當 R^1 為未經取代之苯基， R^3 與 R^4 一起形成環R-2，Z為S，X為O且Y為O時， R^2 不為 C_3-C_4 烷氧基烷基；及(h)當 R^1 為Br， R^3 與 R^4 一起形成環R-2，Z為S，X為O且Y為O時， R^2 不為 CH_2CH_3 。

實施例52. 實施例51之化合物，其中X為O。

實施例53. 實施例51之化合物，其中Y為O。

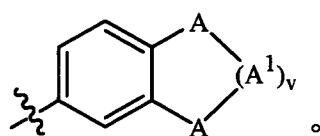
實施例54. 實施例51之化合物，其中 R^1 為苯基、萘基或5或6員雜芳環，各自視情況經1至3個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_4 鹵烷基羰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_2-C_4 烷基胺基羰基、 C_3-C_7 二烷基胺基羰基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 C_1-C_4 烷基胺基及 C_2-C_6 二烷基胺

基。

實施例 55. 實施例 54 之化合物，其中 R^1 為視情況經 1 或 2 個獨立選自由鹵素、氰基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 C_1 - C_2 烷氧基及 C_1 - C_2 鹵烷氧基組成之群之取代基取代的苯基。

實施例 56. 實施例 54 之化合物，其中 R^1 為視情況經鹵素、氰基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基取代之 2-吡啶基、3-吡啶基或 4-吡啶基。

實施例 57. 式 1r 化合物，其中 R^1 為



實施例 58. 實施例 51 之化合物，其中 R^2 為 C_2 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_3 - C_6 烯基或 C_3 - C_6 鹵烯基。

實施例 59. 實施例 51 之化合物，其中 R^2 為 CH_2CF_3 或 CR^5R^6Q 。

實施例 60. 實施例 59 之化合物，其中 R^2 為 CR^5R^6Q 。

實施例 61. 實施例 59 之化合物，其中 R^2 為 CH_2CF_3 。

實施例 62. 實施例 51 或實施例 60 之化合物，其中 R^5 為 H 或 CH_3 。

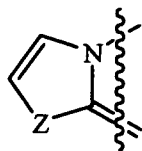
實施例 63. 實施例 51 或實施例 60 之化合物，其中 R^6 為 H。

實施例 64. 實施例 51 之化合物，其中 Q 為 Q-1a、Q-2a、Q-3a、Q-4a 或 Q-5a。

實施例 65. 實施例 64 之化合物，其中 Q 為 Q-1a 或 Q-5a。

實施例 66. 實施例 51 之化合物，其中 R^9 為 F 或 Cl。

實施例 67. 實施例 51 之化合物，其中 R^3 及 R^4 與相鄰連接之氮及碳原子一起形成環 R-2

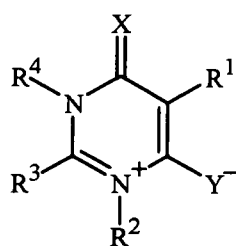


R-2。

實施例 68. 實施例 51 或實施例 67 之化合物，其中 Z 為 $CH=CH$ 。

實施例 69. 實施例 51 或實施例 67 之化合物，其中 Z 為 S。

實施例 70. 式 1s 化合物



1s

其中

X 為 O 或 S；

Y 為 O 或 S；

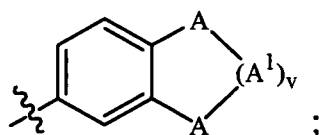
R^1 為 H、鹵素、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 鹵炔基或 $C\equiv CR^{10}$ ；或

R^1 為 C_3 - C_6 環烷基或 C_4 - C_7 環烷基烷基，各自視情況經 1 至 4 個獨立選自由鹵素、 C_1 - C_2 烷基、1 個環丙基及 1 個 CF_3 組成之群之取代基取代；或

R^1 為苯基、萘基或 5 或 6 員雜芳環，各自視情況經 1 至 3 個

獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_4 鹵烷基羰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_2-C_4 烷基胺基羰基、 C_3-C_7 二烷基胺基羰基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 C_1-C_4 烷基胺基及 C_2-C_6 二烷基胺基；或

R^1 為



A 各自獨立地為 $C(R^{16})_2$ 、 O 、 S 或 NR^{15} ；

A^1 各自獨立地為 $C(R^{17})_2$ ；

R^2 為 C_2-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_3-C_6 烯基、 C_3-C_6 鹵烯基、 C_3-C_6 炔基、 C_3-C_6 鹵炔基或 C_2-C_6 烷氧基烷基；或

R^2 為 C_3-C_6 環烷基或 C_4-C_7 環烷基烷基，各自視情況經1至4個選自由鹵素、 C_1-C_2 烷基、1個環丙基及1個 CF_3 組成之群之取代基取代；或

R^2 為 CR^5R^6Q ；

R^3 為 H 、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_2-C_6 鹵炔基或 $C\equiv CR^{10}$ ；或

R^3 為 C_3-C_6 環烷基或 C_4-C_7 環烷基烷基，各自視情況經1至4個獨立選自由鹵素、 C_1-C_2 烷基、1個環丙基及1個 CF_3 組成之群之取代基取代；或

R^3 為苯基、萘基或5或6員雜芳環，各自視情況經1或2個

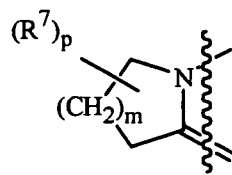
獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 C_1 - C_4 烷基胺基及 C_2 - C_6 二烷基胺基；

R^4 為 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 鹵炔基或 $C\equiv CR^{10}$ ；或

R^4 為 C_3 - C_6 環烷基或 C_4 - C_7 環烷基烷基，各自視情況經1至4個獨立選自由鹵素、 C_1 - C_2 烷基、1個環丙基及1個 CF_3 組成之群之取代基取代；或

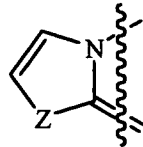
R^4 為苯基、萘基或5或6員雜芳環，各自視情況經1或2個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 C_1 - C_4 烷基胺基及 C_2 - C_6 二烷基胺基；或

R^3 及 R^4 與相鄰連接之氮及碳原子一起形成視情況經取代之環R-1



R-1

或視情況經取代之芳環 R-2



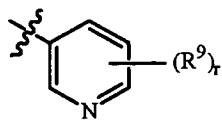
R-2 ;

Z 為 $C(R^8)=C(R^8)$;

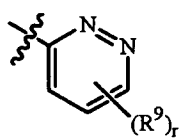
R^5 為 H、F、Cl、氟基或 C_1-C_4 烷基 ;

R^6 為 H、F、Cl 及 CH_3 ;

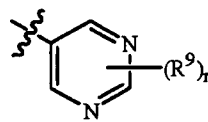
Q 為



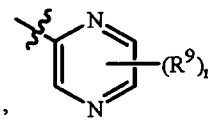
Q-1a



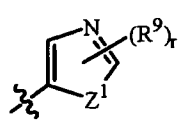
Q-2a



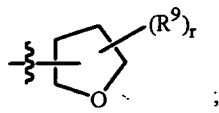
Q-3a



Q-4a



Q-5a



Q-6a

Z^1 為 O、S 或 NR^{14} ;

R^7 為 H、鹵素、氟基、 CF_3 、 C_1-C_3 烷基或 C_3-C_6 環烷基 ;

R^8 各自獨立地為 H 或 F ;

R^9 各自獨立地為 H、鹵素、氟基、硝基、 C_1-C_4 烷基、
 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 鹵烯基、 C_2-C_4 炔
 基、 C_2-C_4 鹵炔基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、

C₂-C₄烷基羰基、C₂-C₄鹵烷基羰基、C₂-C₄烷氧基羰基、C₂-C₄鹵烷氧基羰基、C(O)NH₂、C₂-C₄烷基胺基羰基、C₃-C₇二烷基胺基羰基、C₂-C₄鹵烷基胺基羰基、C₃-C₇鹵二烷基胺基羰基或S(O)_nR¹²；或

R⁹各自獨立地為C₃-C₆環烷基或C₄-C₇環烷基烷基，各自視情況經1至4個選自由鹵素、C₁-C₂烷基、1個環丙基及1個CF₃組成之群之取代基取代；

R¹⁰各自獨立地為Si(R¹¹)₃；或視情況經以下各基取代之苯基：鹵素、氰基、硝基、C₁-C₄烷基、C₂-C₄烯基、C₂-C₄炔基、C₁-C₄鹵烷基、C₂-C₄烷基羰基、C₂-C₄鹵烷基羰基、C₂-C₄烷氧基羰基、C₂-C₄烷基胺基羰基、C₃-C₇二烷基胺基羰基、C₂-C₆烷氧基烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、S(O)_nR¹²、C₁-C₄烷基胺基及C₂-C₆二烷基胺基；

R¹¹各自獨立地為C₁-C₄烷基；

R¹²各自獨立地為C₁-C₄烷基或C₁-C₄鹵烷基；

R¹⁴為C₁-C₄烷基；

R¹⁵各自獨立地為C₁-C₄烷基；

R¹⁶各自獨立地為H或C₁-C₄烷基；

R¹⁷各自獨立地為H或F；

m為1、2或3；

n各自獨立地為0、1或2；

p為0、1、2、3或4；

r各自獨立地為0、1或2；且

v 為 1 或 2 ；

其限制條件為 (a) 當 R^2 為 $CH_2CH=CH_2$ ， R^3 與 R^4 一起形成碳環 **R-2**，Z 為 $CH=CH$ ，X 為 O 且 Y 為 O 時， R^1 不為 H、 $CH(CH_3)_2$ 、 $CH_2CH_2CH_2CH_3$ 、 $CH_2CH=CH_2$ 或未經取代之苯基；(b) 當 R^1 為 H， R^3 與 R^4 一起形成碳環 **R-2**，Z 為 $CH=CH$ ，X 為 O 且 Y 為 O 時， R^2 不為 $CH_2CH=CH_2$ 或 $CH_2C\equiv CH$ ；(c) 當 R^1 為 CH_2CH_3 ， R^3 與 R^4 一起形成碳環 **R-2**，Z 為 $CH=CH$ ，X 為 O 且 Y 為 O 時， R^2 不為 $CH_2(CH_2)_3CH_3$ ；及 (d) 當 R^3 為 H， R^2 與 R^4 均為環己基，X 為 O 且 Y 為 O 時， R^1 不為 CH_3 。

實施例 71. 實施例 70 之化合物，其中 X 為 O。

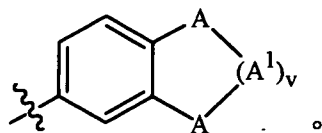
實施例 72. 實施例 70 之化合物，其中 Y 為 O。

實施例 73. 實施例 70 之化合物，其中 R^1 為苯基、萘基或 5 或 6 員雜芳環，各自視情況經 1 至 3 個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 C_1 - C_4 烷基胺基及 C_2 - C_6 二烷基胺基。

實施例 74. 實施例 73 之化合物，其中 R^1 為視情況經 1 或 2 個獨立選自由鹵素、氰基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 C_1 - C_2 烷氧基及 C_1 - C_2 鹵烷氧基組成之群之取代基取代的苯基。

實施例 75. 實施例 73 之化合物，其中 R^1 為視情況經鹵素、氰基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 C_1 - C_2 烷氧基及 C_1 - C_2 鹵烷氧基取代之 2-吡啶基、3-吡啶基或 4-吡啶基。

實施例 76. 實施例 70 之化合物，其中 R^1 為



實施例 77. 式 1s 化合物，其中 R^2 為 C_2 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_3 - C_6 烯基或 C_3 - C_6 鹵烯基。

實施例 78. 實施例 70 之化合物，其中 R^2 為 CH_2CF_3 或 CR^5R^6Q 。

實施例 79. 實施例 78 之化合物，其中 R^2 為 CR^5R^6Q 。

實施例 80. 實施例 78 之化合物，其中 R^2 為 CH_2CF_3 。

實施例 81. 實施例 70 或實施例 79 之化合物，其中 R^5 為 H 或 CH_3 。

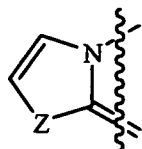
實施例 82. 實施例 70 或實施例 79 之化合物，其中 R^6 為 H。

實施例 83. 實施例 70 之化合物，其中 Q 為 Q-1a、Q-2a、Q-3a、Q-4a 或 Q-5a。

實施例 84. 實施例 83 之化合物，其中 Q 為 Q-1a 或 Q-5a。

實施例 85. 實施例 70 之化合物，其中 R^9 為 F 或 Cl。

實施例 86. 實施例 70 之化合物，其中 R^3 及 R^4 與相鄰連接之氮及碳原子一起形成視情況經取代之芳環 R-2



R-2。

實施例 87. 實施例 70 或實施例 86 之化合物，其中 Z 為
 $\text{CH}=\text{CH}$ 。

值得注意的為式 1、1r 及 1s 之化合物或實施例 1-87 中任一者之化合物(其中 X 及 Y 為 O)、包含該化合物之組合物及其用於控制無脊椎害蟲之用途。

本發明之實施例(包括上文實施例 1-87 以及本文所述之任何其他實施例)可以任何方式組合，且該等實施例中之變數的描述不僅適合於式 1、1r 及 1s 之化合物，且亦適合於可用於製備式 1、1r 及 1s 之化合物的起始化合物及中間化合物。此外，本發明之實施例(包括上文實施例 1-87 以及本文所述之任何其他實施例)及其任何組合適合於本發明之組合物及方法。

實施例 1-50 之組合由以下說明：

實施例 A. 式 1 化合物，其中

X 為 O 或 NR^{22} ；

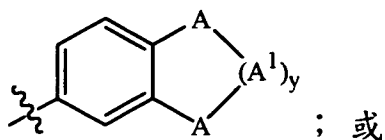
Y 為 O 或 NR^{22} ；

R^1 為 H 或鹵素；或

R^1 為苯基或 6 員雜芳環，各自視情況經 1 至 3 個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 鹵烯基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰基、 $\text{C}(\text{O})\text{N}-(\text{---CH}_2\text{Z}^2\text{CH}_2\text{---})$ 、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{12}$ 、 $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{13}$ 、 C_1 - C_4 烷基胺基、 C_2 - C_6 二烷基

胺基、 SF_5 、 $\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ 、 CHO 、羥基、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{19}$ 及
 $\text{N}(\text{R}^{20})\text{C}(\text{O})\text{R}^{19}$ ；或

R^1 為



R^1 為 $\text{C}(\text{X}^1)\text{R}^{18}$ 或 $\text{C}(=\text{NOR}^{23})\text{R}^{18}$ ；或

R^1 為 8 至 10 員雜芳族雙環環系統，其視情況在碳環成員
 上經至多 3 個獨立選自由以下各基組成之群之取代
 基取代：鹵素、氰基、硝基、 SF_5 、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4
 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、
 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺
 基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰基、 $\text{C}(\text{O})\text{N}$
 $(-\text{CH}_2\text{Z}^2\text{CH}_2-)$ 、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、
 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{12}$ 、 $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{13}$ 、 C_1 - C_4 烷基
 胺基、 C_2 - C_6 二烷基胺基、 $\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ 、 CHO 、羥基、
 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{19}$ 及 $\text{N}(\text{R}^{20})\text{C}(\text{O})\text{R}^{19}$ ，且視情況在氮環成員上
 經甲基取代；或

R^1 為 苯基 或 5 或 6 員雜芳環，各自經 GQ^1 取代且視情況進
 一步經 1 或 2 個獨立選自由以下各基組成之群之取代
 基取代：鹵素、氰基、硝基、 SF_5 、 C_1 - C_4 烷基、
 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷基
 羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4
 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰基、 $\text{C}(\text{O})\text{N}$
 $(-\text{CH}_2\text{Z}^2\text{CH}_2-)$ 、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、

C_2-C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 $S(O)_2R^{13}$ 、 C_1-C_4 烷基
 胺基、 C_2-C_6 二烷基胺基、 $Si(CH_3)_3$ 、 CHO 、羥基、
 $OC(O)R^{19}$ 及 $N(R^{20})C(O)R^{19}$ ；

G 為一直接鍵；

Q^1 為苯基或 5 或 6 員雜芳環，各自視情況經 1 至 3 個獨立
 選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氟
 基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、
 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_4 鹵烷基羰基、
 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_2-C_4 烷基胺基羰基、 C_3-C_7 二烷
 基胺基羰基、 $C(O)N-(CH_2Z^2CH_2)-$ 、 C_1-C_4 烷氧
 基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、
 $S(O)_2R^{13}$ 、 C_1-C_4 烷基胺基、 C_2-C_6 二烷基胺基、
 SF_5 、 $Si(CH_3)_3$ 、 CHO 、羥基、 $OC(O)R^{19}$ 及
 $N(R^{20})C(O)R^{19}$ ；

R^2 為 C_2-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 $CH_2CO_2R^{21}$ 、
 $CR^5R^6CH_2OR^{21}$ 、 $CR^5R^6CH_2CH_2OR^{21}$ 、 $CR^5R^6CH_2S$
 $(O)_nR^{21}$ 或 $CR^5R^6CH_2CH_2S(O)_nR^{21}$ ；或

R^2 為 C_3-C_6 環烷基或 C_4-C_7 環烷基烷基，各自視情況經 1
 至 4 個選自由鹵素、 C_1-C_2 烷基、1 個環丙基及 1 個
 CF_3 組成之群之取代基取代；或

R^2 為 CR^5R^6Q ；

R^3 為 H、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6
 鹵烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_2-C_6 鹵炔基或 $C\equiv CR^{10}$ ；或

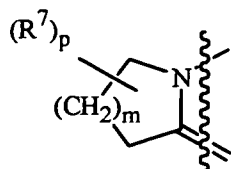
R^3 為 C_3-C_6 環烷基或 C_4-C_7 環烷基烷基，各自視情況經 1

至4個獨立選自由鹵素、 C_1 - C_2 烷基、1個環丙基及1個 CF_3 組成之群之取代基取代；

R^4 為 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_2 - C_6 鹵炔基或 $C\equiv CR^{10}$ ；或

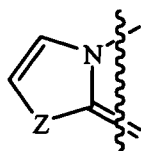
R^4 為 C_3 - C_6 環烷基或 C_4 - C_7 環烷基烷基，各自視情況經1至4個獨立選自由鹵素、 C_1 - C_2 烷基、1個環丙基及1個 CF_3 組成之群之取代基取代；或

R^3 及 R^4 與相鄰連接之氮及碳原子一起形成視情況經取代之環R-1



R-1

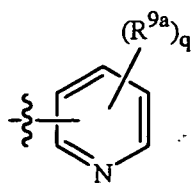
或環R-2



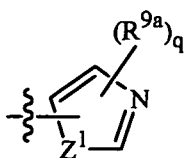
R-2 ;

Z為 $C(R^8)=C(R^8)$ 或S；且

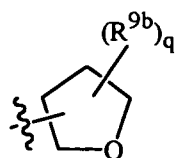
Q為



Q-1

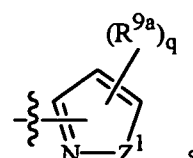


Q-5



Q-6

或



Q-9

實施例B.實施例A之化合物，其中

X為O；且

Y 為 O。

實施例 C. 實施例 B 之化合物，其中

R^3 為 C_1-C_6 烷基或 C_1-C_6 鹵烷基；且

R^4 為 C_1-C_6 烷基或 C_1-C_6 鹵烷基。

實施例 D. 實施例 C 之化合物，其中

R^3 為 CH_3 ；且

R^4 為 CH_3 。

實施例 E. 實施例 B 之化合物，其中

R^3 及 R^4 與相鄰連接之氮及碳原子一起形成視情況經取代

之環 R-1；

m 為 2 或 3；且

p 為 0。

實施例 F. 實施例 B 之化合物，其中

R^3 及 R^4 與相鄰連接之氮及碳原子一起形成視情況經取代

之環 R-2；且

Z 為 $CH=CH$ 或 $CH=CF$ ，其中 $CH=CF$ 部分之取向使得與氮

鍵結之碳原子與嘧啶鎗環稠合相鄰。

實施例 G. 實施例 B 之化合物，其中

R^3 及 R^4 與相鄰連接之氮及碳原子一起形成視情況經取代

之環 R-2；且

Z 為 S。

實施例 H. 實施例 C-G 中任一者之化合物，其中

R^1 為 H 或 鹵素。

實施例 I. 實施例 C-G 中任一者之化合物，其中

R^1 為苯基或吡啶基，各自視情況經1至3個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 鹵烯基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰基、 $C(O)N-(CH_2Z^2CH_2)-$ 、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 $S(O)_2R^{13}$ 、 C_1 - C_4 烷基胺基、 C_2 - C_6 二烷基胺基、 SF_5 、 $Si(CH_3)_3$ 、 CHO 、羥基、 $OC(O)R^{19}$ 及 $N(R^{20})C(O)R^{19}$ 。

實施例J. 實施例I之化合物，其中

R^1 為苯基或吡啶基，各自視情況經1至3個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰基、 $C(O)N-(CH_2Z^2CH_2)-$ 、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 及 $S(O)_2R^{13}$ 。

實施例K. 實施例C-G中任一者之化合物，其中

R^1 為 $C(X^1)R^{18}$ 或 $C(=NOR^{23})R^{18}$ ；且

X^1 為 O。

實施例L. 實施例C-G中任一者之化合物，其中

R^1 為苯基或吡啶基，各自經 GQ^1 取代且視情況進一步經1或2個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 SF_5 、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯

基、C₂-C₄炔基、C₁-C₄鹵烷基、C₂-C₄烷基羰基、C₂-C₄鹵烷基羰基、C₂-C₄烷氧基羰基、C₂-C₄烷基胺基羰基、C₃-C₇二烷基胺基羰基、C(O)N(—CH₂Z²CH₂—)、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₂-C₆烷氧基烷基、S(O)_nR¹²、S(O)₂R¹³、C₁-C₄烷基胺基、C₂-C₆二烷基胺基、Si(CH₃)₃、CHO、羥基、OC(O)R¹⁹及N(R²⁰)C(O)R¹⁹。

實施例M. 實施例L之化合物，其中

R¹為苯基或吡啶基，各自經GQ¹取代且視情況進一步經1或2個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氟基、SF₅、C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵烷基、C₂-C₄烷基羰基、C₂-C₄烷氧基羰基、C₂-C₄烷基胺基羰基、C₃-C₇二烷基胺基羰基、C(O)N(—CH₂Z²CH₂—)、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₂-C₆烷氧基烷基、S(O)_nR¹²及S(O)₂R¹³；且

Q¹為苯基或吡啶基，各自視情況經1至3個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氟基、C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵烷基、C₂-C₄烷基羰基、C₂-C₄烷氧基羰基、C₂-C₄烷基胺基羰基、C₃-C₇二烷基胺基羰基、C(O)N(—CH₂Z²CH₂—)、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₂-C₆烷氧基烷基、S(O)_nR¹²及S(O)₂R¹³。

實施例N. 實施例C-G中任一者之化合物，其中

R²為C₂-C₆烷基、C₁-C₆鹵烷基或CR⁵R⁶CH₂OR²¹；或

R²為C₄-C₇環烷基烷基，視情況經1至4個選自由鹵素、

C_1 - C_2 烷基、1個環丙基及1個 CF_3 組成之群之取代基
取代。

實施例O.實施例C-G中任一者之化合物，其中

R^2 為 CR^5R^6Q 。

實施例P.實施例O之化合物，其中

Q為Q-1、Q-5、Q-6或Q-9；

R^5 為H或甲基；

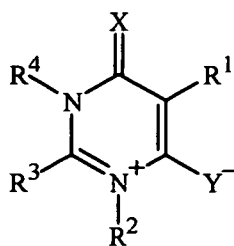
R^6 為H；

R^{9a} 各自獨立地為H、鹵素、氰基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵
烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 SF_5 或
 $S(O)_nR^{12}$ ；或 C_3 - C_6 環烷基或 C_4 - C_7 環烷基烷基，各自
視情況經1至4個選自由鹵素、 C_1 - C_2 烷基、1個環丙
基及1個 CF_3 組成之群之取代基取代；且

R^{9b} 各自獨立地為H、鹵素、氰基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵
烷基、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 鹵烷氧基。

實施例51-69之組合由以下實施例來說明：

實施例A1.式1r化合物



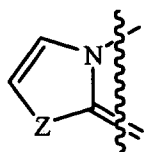
1r

其中

X為O；

Y為O；且

R^3 及 R^4 與相鄰連接之氮及碳原子一起形成環R-2

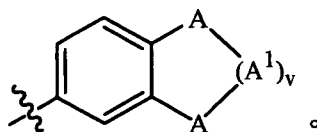


R-2。

實施例B1.實施例A1之化合物，其中

R^1 為苯基、萘基或5或6員雜芳環，各自視情況經1至3個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 C_1 - C_4 烷基胺基及 C_2 - C_6 二烷基胺基；或

R^1 為



實施例C1.實施例B1之化合物，其中

R^2 為 C_2 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_3 - C_6 烯基或 C_3 - C_6 鹵烯基；或

R^2 為 CR^5R^6Q ；且

Q為Q-1a、Q-2a、Q-3a、Q-4a或Q-5a。

實施例D1.實施例C1之化合物，其中

Z為 $CH=CH$ ；

R^1 為視情況經 1 或 2 個獨立選自由鹵素、氰基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 C_1 - C_2 烷氧基及 C_1 - C_2 鹵烷氧基組成之群之取代基取代的苯基；

R^2 為 CH_2CF_3 或 CR^5R^6Q ；

R^5 為 H 或 CH_3 ；

Q 為 Q-1a 或 Q-5a；

R^6 為 H；

R^9 為 F 或 Cl；且

r 為 1。

實施例 E1. 實施例 C1 之化合物，其中

Z 為 S；

R^1 為視情況經 1 或 2 個獨立選自由鹵素、氰基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 C_1 - C_2 烷氧基及 C_1 - C_2 鹵烷氧基組成之群之取代基取代的苯基；

R^2 為 CH_2CF_3 或 CR^5R^6Q ；

R^5 為 H 或 CH_3 ；

Q 為 Q-1a 或 Q-5a；

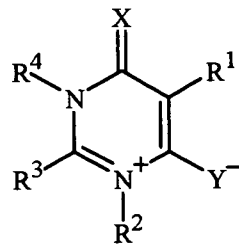
R^6 為 H；

R^9 為 F 或 Cl；且

r 為 1。

實施例 70-87 之組合藉由以下實施例來說明：

實施例 A2. 式 1s 化合物



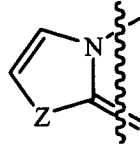
1s

其中

X為O；

Y為O；且

R³及R⁴與相鄰連接之氮及碳原子一起形成視情況經取代之芳環R-2

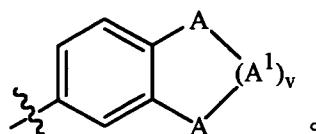


R-2。

實施例B2.實施例A2之化合物，其中

R¹為苯基、萘基或5或6員雜芳環，各自視情況經1至3個獨立選自由以下各基組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、C₁-C₄烷基、C₂-C₄烯基、C₂-C₄炔基、C₁-C₄鹵烷基、C₂-C₄烷基羰基、C₂-C₄鹵烷基羰基、C₂-C₄烷氧基羰基、C₂-C₄烷基胺基羰基、C₃-C₇二烷基胺基羰基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₂-C₆烷氧基烷基、S(O)_nR¹²、C₁-C₄烷基胺基及C₂-C₆二烷基胺基；或

R¹為



實施例 C₂ 實施例 B2 之化合物，其中

R² 為 C₂-C₆ 烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₃-C₆ 烯基或 C₃-C₆ 鹵烯基；或

R² 為 CR⁵R⁶Q；且

Q 為 Q-1a、Q-2a、Q-3a、Q-4a 或 Q-5a。

實施例 D2. 實施例 C2 之化合物，其中

Z 為 CH=CH；

R¹ 為視情況經 1 或 2 個獨立選自由鹵素、氰基、C₁-C₂ 鹵烷基、C₁-C₂ 烷氧基及 C₁-C₂ 鹵烷氧基組成之群之取代基取代的苯基；

R² 為 CH₂CF₃ 或 CR⁵R⁶Q；

R⁵ 為 H 或 CH₃；

Q 為 Q-1a 或 Q-5a；

R⁶ 為 H；

R⁹ 為 F 或 Cl；且

r 為 1。

特定實施例包括選自由以下各物組成之群之式 1 化合物：

3-(2,4-二氟苯基)-2-羥基-4-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎬內鹽；

3-(4-氟苯基)-2-羥基-4-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎬內鹽；

1-[(6-氟-3-吡啶基)甲基]-3-(2,4-二氟苯基)-2-羥基-4-側

氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎊內鹽；

1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-3-(4-氟苯基)-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎊內鹽；

3-(3-氯苯基)-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎊內鹽；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-3-[3-(三氟甲基)苯基]-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎊內鹽；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-3-[3-(三氟甲氧基)苯基]-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎊內鹽；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(4-氟苯基)-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎊內鹽；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-3-苯基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎊內鹽；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(2,4-二氟苯基)-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎊內鹽；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-3-(4-甲氧基苯基)-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎊內鹽；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-3-(3-甲氧基苯基)-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎊內鹽；

1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-3-(4-氟苯基)-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎊內鹽；

3-(3-溴苯基)-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎊內鹽；

3-(3-溴苯基)-1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎊內鹽；

1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-3-[3-(三氟甲氧基)苯基]-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-3-[4-(三氟甲基)-2-吡啶基]-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(2-氯基苯基)-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

8-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-7-羥基-5-側氧基-6-苯基-5*H*-噻唑并[3,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

8-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-6-(4-氯苯基)-7-羥基-5-側氧基-5*H*-噻唑并[3,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

8-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-7-羥基-5-側氧基-6-[3-(三氟甲氧基)苯基]-5*H*-噻唑并[3,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

8-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-7-羥基-5-側氧基-6-苯基-5*H*-噻唑并[3,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

8-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-6-(4-氯苯基)-7-羥基-5-側氧基-5*H*-噻唑并[3,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

8-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-7-羥基-5-側氧基-6-[3-(三氟甲氧基)苯基]-5*H*-噻唑并[3,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

3-[3-(6-氯-3-吡啶基)苯基]-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-3-[3-(三氟甲氧基)苯基]-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

3-(5-氯-2-氯苯基)-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[2-氯-5-(三氟甲氧基)苯基]

- 2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；
- 3-(4-氟苯基)-2-羥基-1-[(1-甲基-1*H*-吡啶-4-基)甲基]-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；
- 2-羥基-1-[(1-甲基-1*H*-吡啶-4-基)甲基]-4-側氧基-3-苯基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；
- 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(3,5-二甲氧基苯基)-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；
- 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；
- 3-(2-氯-4-吡啶基)-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；
- 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(2-氟-5-溴苯基)-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；
- 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-3-(2,4,5-三氟苯基)-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；
- 3-[3-溴-5-(三氟甲氧基)苯基]-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；
- 3-[3-溴-5-(三氟甲基)苯基]-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；
- 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[2-氟-5-(三氟甲基)苯基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；
- 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-3-(2-甲氧基苯基)-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；
- 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(2-氟苯基)-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

8-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-6-(2-氟苯基)-7-羥基-5-側氧基-5*H*-噻唑并[3,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

2-羥基-4-側氧基-3-苯基-1-(2,2,2-三氟乙基)-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

3-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-5-(4-氟苯基)-3,6-二氫-4-羥基-1,2-二甲基-6-側氧基嘧啶鎬內鹽；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-[3-(6-氯-3-吡啶基)-5-(三氟甲基)苯基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

1-[1-(6-氯-3-吡啶基)乙基]-3-(4-氟苯基)-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-3-(乙氧基羰基)-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

3-苯甲醯基-1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

3-(2,4-二氟苯基)-1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-羥基-3-(3-甲氧基苯基)-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-3-(2,3-二氟苯基)-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-3-(2-氟-3-甲氧基苯基)-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

3-(3,5-二甲氧基苯基)-1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

1-[(6-氟-3-吡啶基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-3-[3-(三氟甲基)苯基]-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

3-(4-氟苯基)-2-羥基-1-[(2-甲基-5-噻唑基)甲基]-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

2-羥基-4-側氧基-3-苯基-1-[(5-噻唑基)甲基]-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

3-(4-氟苯基)-2-羥基-4-側氧基-1-[(5-噻唑基)甲基]-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

3-(2-氟苯基)-1-[(6-氟-3-吡啶基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

1-[(6-氟-3-吡啶基)甲基]-3-[2-氟-5-(三氟甲基)苯基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

3-(2-氟-4-氟基苯基)-1-[(6-氟-3-吡啶基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；

1-[(6-氟-3-吡啶基)甲基]-3-[2-氟-5-(三氟甲基)苯基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽；及

1-[(2-氟-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-3-[3-(6-三氟甲基-3-吡啶基)苯基]-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎬內鹽。

值得注意的為，本發明之化合物特徵在於有利之代謝及/或土壤殘留模式且展示控制一定譜系之農藝及非農藝無脊椎害蟲之活性。

尤其值得注意的為，出於無脊椎害蟲控制譜及經濟價值之原因，藉由控制無脊椎害蟲來保護農作物免遭無脊椎害蟲造成之損害或傷害為本發明之實施例。因為本發明之化合物在植物中具有有利的遷移性質或系統性，所以其亦保

護與式1化合物或包含該化合物之組合物不直接接觸的葉枝或其他植物部分。

亦值得注意的本發明之實施例為包含任何前述實施例以及本文所述之任何其他實施例及其任何組合之化合物及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑及液體稀釋劑組成之群之其他組份的組合物，該等組合物視情況進一步包含至少一種其他生物學活性化合物或藥劑。

另外值得注意的本發明之實施例為用於控制無脊椎害蟲之組合物，其包含生物學有效量之任何前述實施例以及本文所述之任何其他實施例及其任何組合之化合物及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑及液體稀釋劑組成之群之其他組份，該等組合物視情況進一步包含生物學有效量之至少一種其他生物學活性化合物或藥劑。

本發明之實施例亦包括一種用於保護動物之組合物，其包含任何前述實施例之化合物(亦即，殺寄生蟲有效量)及載劑。

本發明之實施例進一步包括用於控制無脊椎害蟲之方法，其包含使該無脊椎害蟲或其環境與生物學有效量之任何前述實施例之化合物(例如，呈本文所述之組合物之形式)接觸。尤其值得注意的為一種用於保護動物之方法，其包含向該動物投與殺寄生蟲有效量之任何前述實施例之化合物(例如，呈本文所述之組合物之形式)。

本發明之實施例亦包括一種呈土壤澆灌液體調配物之形式的任何前述實施例之化合物之組合物。本發明之實施例

進一步包括用於控制無脊椎害蟲之方法，其包含使土壤與呈土壤澆灌液形式之包含生物學有效量之任何前述實施例之化合物的液體組合物接觸。

本發明之實施例亦包括一種用於控制無脊椎害蟲之噴霧組合物，其包含生物學有效量之任何前述實施例之化合物及推進劑。本發明之實施例進一步包括一種用於控制無脊椎害蟲之誘餌組合物，其包含生物學有效量之任何前述實施例之化合物、一或多種食物材料、視情況之引誘劑及視情況之保濕劑。本發明之實施例亦包括一種用於控制無脊椎害蟲之裝置，其包含該誘餌組合物及一適合於收納該誘餌組合物之外殼，其中該外殼具有至少一個開口，該開口之尺寸訂定為允許該無脊椎害蟲通過該開口，因此該無脊椎害蟲可自外殼外部之位置接近該誘餌組合物，且其中該外殼進一步適合於置放在無脊椎害蟲之潛在或已知活動地點或其附近。

本發明之實施例亦包括一種用於保護種子免遭無脊椎害蟲侵襲之方法，其包含使該種子與生物學有效量之任何前述實施例之化合物(例如，呈本文所述之組合物之形式)接觸。

本發明之實施例亦包括用於保護動物免遭無脊椎寄生害蟲侵襲之方法，其包含向該動物投與殺寄生蟲有效量之任何前述實施例之化合物。

本發明之實施例亦包括用於控制無脊椎害蟲之方法，其包含使該無脊椎害蟲或其環境與生物學有效量之式1化合物、其N-氧化物或鹽(例如，呈本文所述之組合物之形式)

接觸，其限制條件為該等方法並非藉由療法在醫學上治療人類或動物身體之方法。

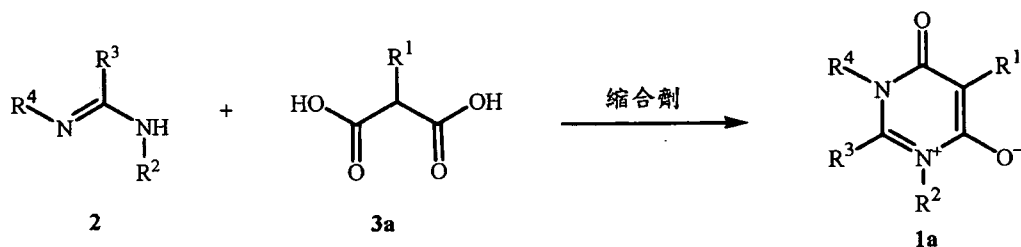
本發明亦係關於該等方法，其中使該無脊椎害蟲或其環境與包含生物學有效量之式1化合物、其N-氧化物或鹽及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑及液體稀釋劑組成之群之其他組份的組合物接觸，該組合物視情況進一步包含生物學有效量之至少一種其他生物學活性化合物或藥劑，其限制條件為該等方法並非藉由療法在醫學上治療人類或動物身體之方法。

以下如流程1-20中所述之一或多種方法及變體可用於製備式1化合物。除非另外說明，否則下文式1-22之化合物中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{18} 、 R^{23} 、X及Y之定義係如上文發明內容中所定義。式1a-11為式1之多個子集，且除非另外指示，否則式1a-11之所有取代基係如上文針對式1所定義。周圍溫度或室溫係定義為約20-25°C。

如流程1中所示，可藉由使適當經取代之式2化合物與視情況經取代之丙二酸(3a)在縮合劑存在下縮合來製備式1a化合物(亦即，其中X及Y為O之式1)。縮合劑可為碳化二亞胺，諸如二環己基碳化二亞胺(參見例如Koch, A.等人，*Tetrahedron* 2004, 60, 10011-10018)或此項技術中熟知之在活化劑存在或不存在下形成醯胺鍵之其他試劑，諸如N-羥基苯并三唑，如*Science of Synthesis* 2005, 21, 17-25及*Tetrahedron* 2005, 61, 10827-10852中所述。此反應通常在惰性有機溶劑(諸如，二氯甲烷或1,2-二氯乙烷)中於約0°C

至約80°C下進行10 min至數天之時間。

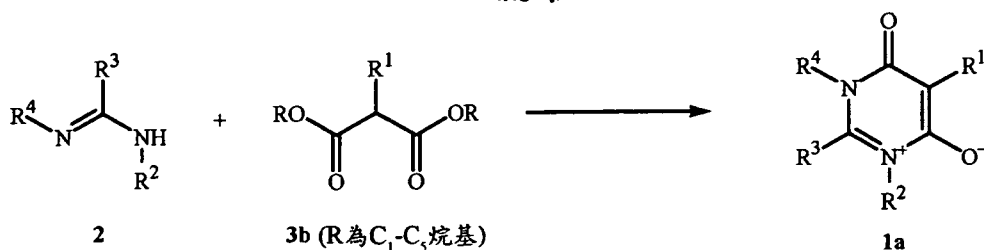
流程 1



如流程2中所示，亦可藉由使式2化合物與R為C₁-C₅烷基、較佳C₁-C₄烷基之丙二酸酯(3b)縮合來製備式1a化合物。如 *Bulletin of the Chemical Society of Japan* 1999, 72(3), 503-509中所述，此等反應可在無添加劑下或在惰性溶劑存在下進行。惰性溶劑包括(但不限於)高沸點烴，諸如均三甲苯、萘滿或對-甲-異丙苯，或高沸點醚，諸如二苯醚。典型溫度在50°C至250°C之範圍內。值得注意的為150°C至200°C之溫度，其通常提供快速反應時間及高產率。此等反應亦可在微波反應器中在相同溫度範圍內進行。典型反應時間在5 min至數小時之範圍內。

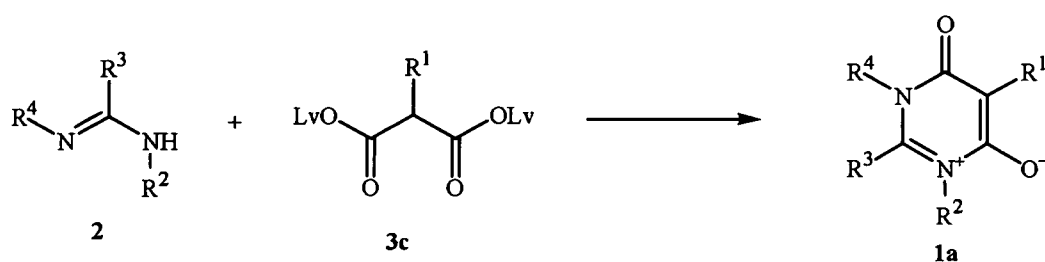
式3a化合物可藉由此項技術中已知之多種方法製備，例如藉由使式3b化合物鹼水解來製備。式3b化合物可藉由鈮(*J. Org. Chem* 2002, 67, 541-555)或銅(*Org. Lett.* 2002, 4, 269-272及*Org. Lett.* 2005, 7, 4693-4695)催化之丙二酸酯芳基化來製備。

流程 2



如流程3中所示，亦可藉由用LvO為活性離去基之式3c之活性酯處理式2化合物來製備式1a化合物。便於合成或反應較佳之Lv的實例為2,4,6-三氯苯基、五氯苯基或五氟苯基，如*Archiv der Pharmazie* (Weinheim, Germany) 1991, 324, 863-6中所述。其他活性酯在此項技術中熟知且包括(但不限於)N-羥基琥珀醯亞胺酯(參見例如*J. Am. Chem. Soc.* 2002, 124, 6872-6878)。典型溫度在50°C至200°C之範圍內。值得注意的為50°C至150°C之溫度，其通常提供快速反應時間及高產率。此等反應可在溶劑(諸如，甲苯)存在或不存在下且在微波反應器中在相同溫度範圍內進行。典型反應時間在5 min至2 h之範圍內。

流程3

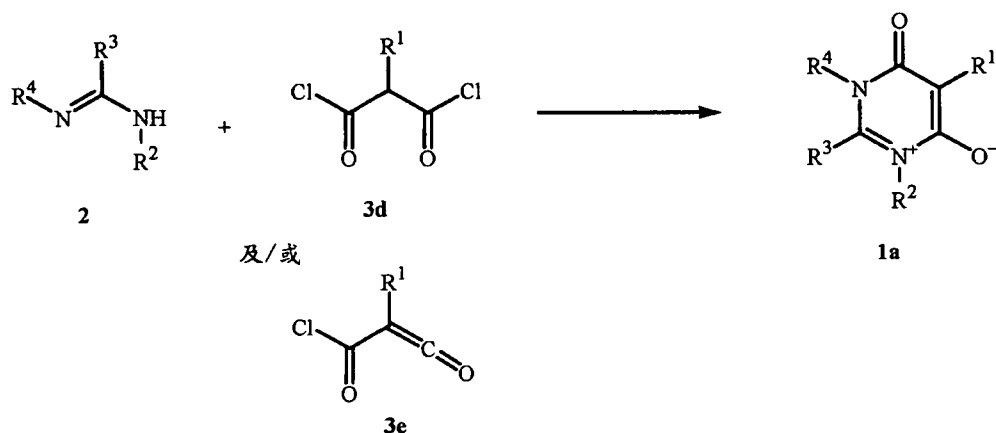


式3c化合物可(例如)由式3a化合物製備(參見例如*J. Het. Chem.* 1980, 17, 337)。

如流程4中所示，亦可藉由使式2化合物與式3d或3e化合物縮合或使式2化合物與式3d與3e化合物之混合物縮合來製備R¹不為H之式1a化合物。此等反應通常在惰性溶劑(諸如，二氯甲烷)中且視情況在兩當量或兩當量以上之酸受體存在下進行(參見例如*Zeitschrift für Naturforschung, Teil B: Anorganische Chemie, Organische Chemie* 1982, 37B(2),

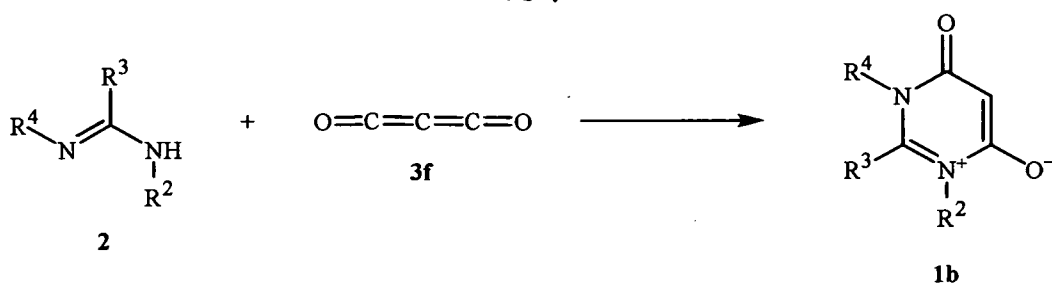
222-33)。典型酸受體包括(但不限於)三乙胺、*N,N*-二異丙基乙胺、吡啶及經取代之吡啶。

流程 4



如流程 5 中所示，式 1b 化合物(亦即， R^1 為 H 之式 1a)可藉由使式 2 化合物與二氧化三碳(3f)縮合來製備(參見例如 *J. Org. Chem.* 1972, 37(9), 1422-5)。該等反應通常在惰性溶劑(諸如，醚)中進行且可包括諸如 AlCl_3 之催化劑的使用。

流程 5

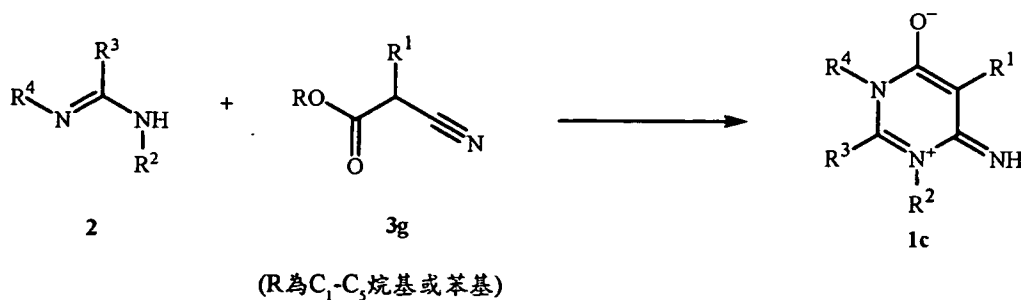


式 2 化合物可以此項技術中已知之多種方式來製備；參見例如 Patai, S. *The Chemistry of Functional Groups: The Chemistry of Amidines and Imidates*; Wiley: Chichester, UK, 1975; *The Chemistry of Amidines and Imidates*; Patai, S.、Rappoport, Z. 編；Wiley: Chichester, UK, 1991；第 2 卷；Mega, T. 等人，*Bulletin of the Chemical Society of Japan* 1988, 61(12), 4315-21；Ife, R. 等人，*European*

Journal of Medicinal Chemistry 1989, 24(3), 249-57 ;
 Wagaw, S.、Buchwald, S. *Journal of Organic Chemistry*
 1996, 61(21), 7240-7241 ; Shen, Q. 等人, *Angewandte*
Chemie, 國際版 2005, 44(9), 1371-1375及 Okano, K. 等人,
Organic Letters 2003, 5(26), 4987-4990。

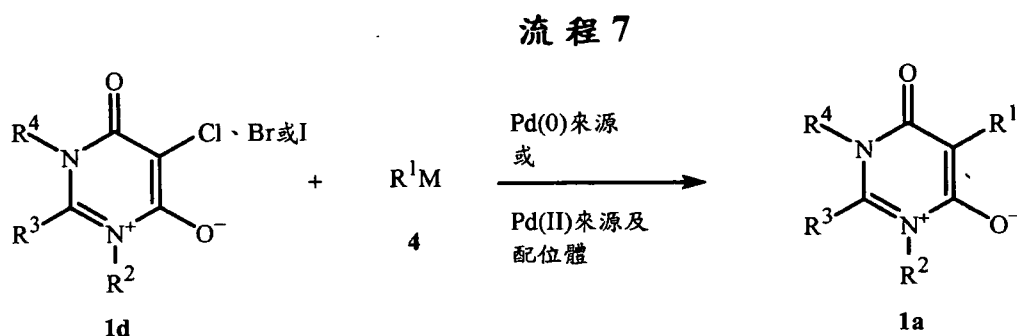
如流程6中所示，式1c化合物(亦即，X為O且Y為NH之式1)可藉由使適當經取代之式2化合物與視情況經取代之式3g之腈酯縮合來製備。反應通常經由原位產生醯胺之中間環節進行。在典型程序中，將化合物組合於高沸點溶劑中且加熱18至72小時。視條件而定，諸如吡啶或三乙胺之胺鹼或諸如對甲苯磺酸之質子酸或諸如三氟化硼之路易斯酸(Lewis acid)可用以驅使反應完成。反應可在多種高沸點溶劑(包括甲苯、二甲苯、對-甲-異丙苯、伸四氫萘)中進行，最佳溫度在100°C至溶劑回流溫度之範圍內。用於該等環化之通用程序可見於 *Journal of Heterocyclic Chemistry* 2006, 43, 1523-1531及 *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters* 2006, 16, 891-896中。

流程 6

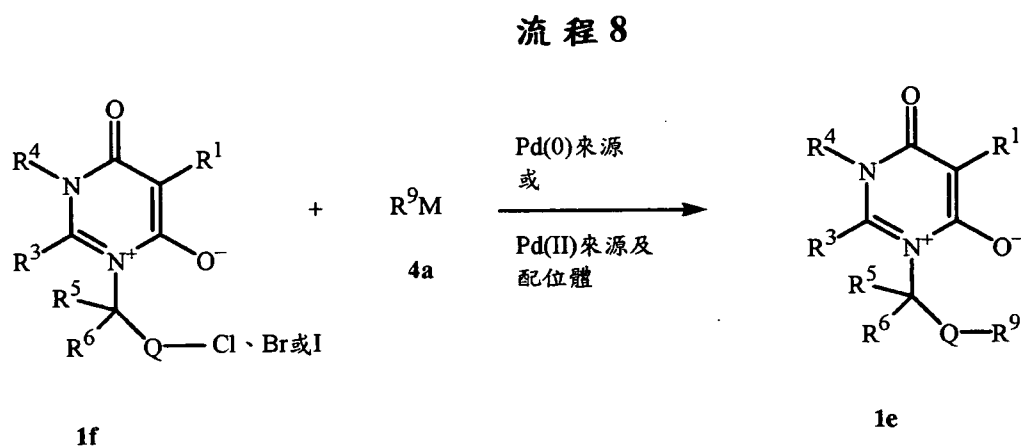


如流程7中所示，可由式1d化合物(亦即，R¹為Cl、Br或I，較佳R¹為Br或I之式1a)及M與R⁹形成 酸、 酸酯或三

氟硼酸鹽或M為三烷基錫烷基或鋅之式4化合物來製備R¹為CR¹⁷=C(R¹⁷)R¹⁰、視情況經取代之苯基、萘基、5或6員雜芳環或8至10員雜芳族雙環環系統之式1a化合物。

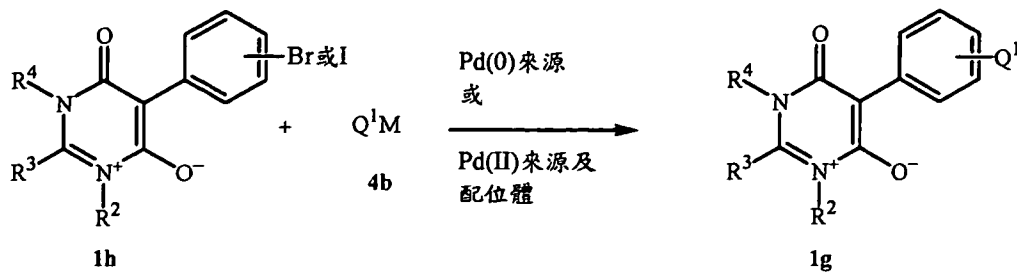


如流程8中所示，可由式1f化合物及M與R⁹形成酸、酸酯或三氟硼酸鹽或M為三烷基錫烷基或鋅且R⁹為苯基或5或6員雜芳環之式4a化合物製備式1e化合物(亦即，R²為CR⁵R⁶Q且Q為經苯基或5或6員雜芳環取代之雜環的式1a)。



如流程9中所示，式1g化合物(亦即，R¹為經GQ¹取代之苯基且G為一直接鍵之式1a)可由式1h化合物(亦即，R¹為經Br或I取代之苯基之式1a)及M與Q¹形成酸、酸酯或三氟硼酸鹽或M為三烷基錫烷基或鋅且Q為苯基或5或6員雜芳環之式4b化合物來製備。

流程 9



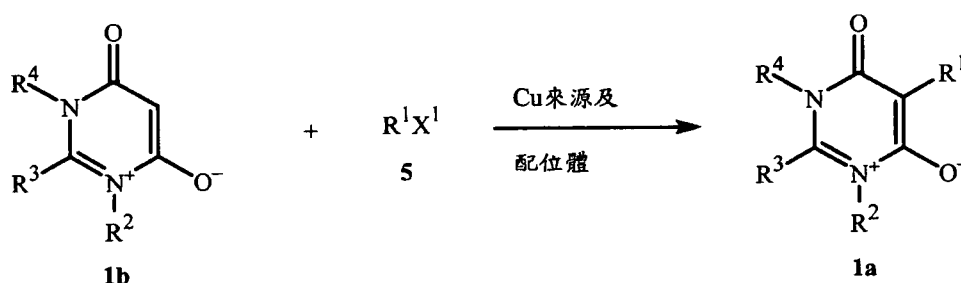
流程 7、8 及 9 之反應通常在鈀催化劑存在下視情況在惰性氣氛下進行。用於流程 7、8 及 9 之反應的鈀催化劑通常包含呈形式氧化態 0 (亦即 Pd(0)) 或 2 (亦即, Pd(II)) 之鈀。多種該等含鈀化合物及錯合物可用作此等反應之催化劑。適用作流程 7、8 及 9 之方法中的催化劑之含鈀化合物及錯合物之實例包括 PdCl₂(PPh₃)₂ (雙(三苯基膦)二氯化鈀 (II))、Pd(PPh₃)₄ (肆(三苯基膦)-鈀 (0))、Pd(C₅H₇O₂)₂ (乙醯丙酮鈀 (II))、Pd₂(dba)₃ (參-(二亞苄基丙酮)二鈀 (0)) 及 [1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵]二氯化鈀 (II)。流程 7、8 及 9 之方法一般在液相中進行, 且因此鈀催化劑較佳在液相中具有良好溶解性最為有效。適用溶劑包括(例如)水、醚(諸如, 1,2-二甲氧基乙烷)、醯胺(諸如, *N,N*-二甲基乙醯胺)及非鹵化芳烴(諸如, 甲苯)。

流程 7、8 及 9 之方法可在約 25°C 至約 200°C 之範圍內的寬溫度範圍內進行。值得注意的為約 60°C 至約 150°C 之溫度, 其通常提供快速反應時間及高產物產率。分別用於與芳基碘化物、溴化物或氯化物及芳基錫、芳基鋅或芳基酸之斯替雷 (Stille)、根岸 (Negishi) 及鈴木 (Suzuki) 偶合的通用方法及程序在文獻中熟知; 參見例如 E. Negishi,

Handbook of Organopalladium Chemistry for Organic Synthesis, Wiley-Interscience, 2002, New York, New York.

如流程 10 中所示，可由式 1b 化合物 (亦即， R^1 為 H 之式 1a) 及 X^1 為 Cl、Br 或 I (較佳 X^1 為 Br 或 I) 之式 5 化合物來製備 R^1 為視情況經取代之苯基、萘基、5 或 6 員雜芳環或 8 至 10 員雜芳族雙環環系統之式 1a 化合物。

流程 10



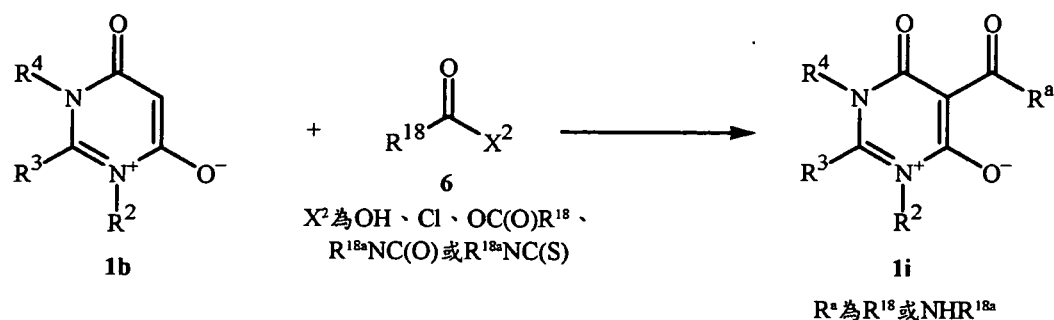
此等反應通常在銅催化劑存在下視情況在惰性氣氛下進行。用於本發明之方法的銅催化劑通常包含呈金屬形式之銅 (例如，呈粉末狀) 或呈形式氧化態 I 之銅 (亦即，Cu(I))。適用作流程 10 之方法中的催化劑之含銅化合物之實例包括 (但不限於) Cu、CuI、CuBr、CuCl。用於流程 10 之方法的適用溶劑包括 (例如) 醚 (諸如，1,4-二噁烷)、醯胺 (諸如，*N,N*-二甲基乙醯胺) 及二甲亞砜。

流程 10 之方法可在 25°C 至 200°C 之範圍內的寬溫度範圍內進行。值得注意的為 40°C 至 150°C 之溫度。流程 10 之方法可在配位體存在下進行。多種該等銅結合化合物可用作本發明之方法的配位體。適用配位體之實例包括 (但不限於) 1,10-菲啉、*N,N*-二甲基乙二胺、L-脯氨酸及 2-吡啶甲酸。用於銅催化之烏爾曼 (Ullmann) 類型偶合反應的通用方

法及程序在文獻中熟知；參見例如 Xie, Ma 等人, *Org. Lett.* **2005**, 7, 4693-4695。

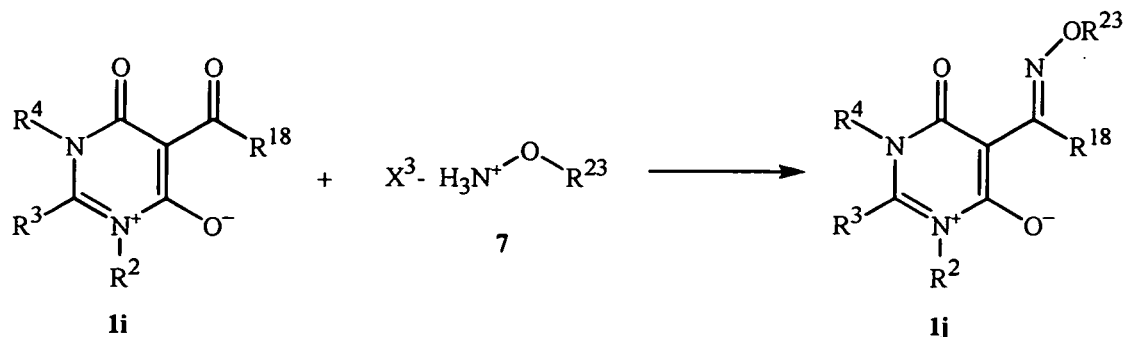
如流程 11 中所示，式 1i 化合物可自式 1b 化合物藉由用式 6 化合物羰基化製備。適用於流程 11 之方法中的式 6 之羰基化試劑之實例包括(但不限於)脂族或芳族羧酸、酸酐、醯基鹵化物、異氰酸酯及異硫氰酸酯。該反應通常在惰性溶劑中、更通常在極性溶劑(諸如，*N,N*-二甲基乙醯胺或 1-甲基-2-吡咯啉酮)中進行。反應通常在 0°C 至 180°C、更通常在周圍溫度至 150°C 之溫度下進行。微波照射可有利於加熱反應混合物。

流程 11



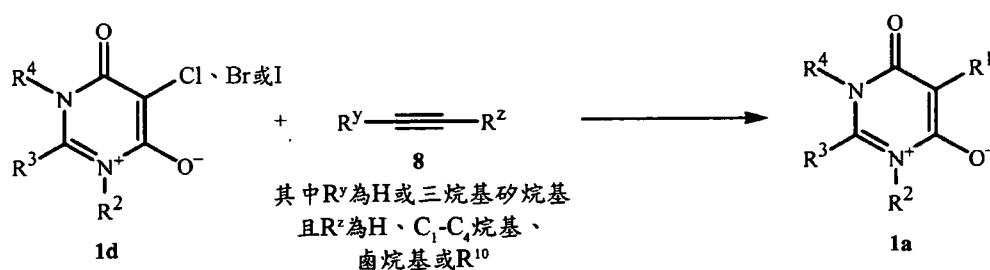
如流程 12 中所示，式 1j 化合物可藉由使式 1i 化合物與 X³ 為抗衡離子(諸如，鹵離子或乙二酸根)之式 7 之烷氧基胺鹽反應來製備。該反應可在醇溶劑(諸如，乙醇或丙醇)中在 80°C 至溶劑回流溫度範圍內之溫度下進行 3 至 24 小時。

流程 12



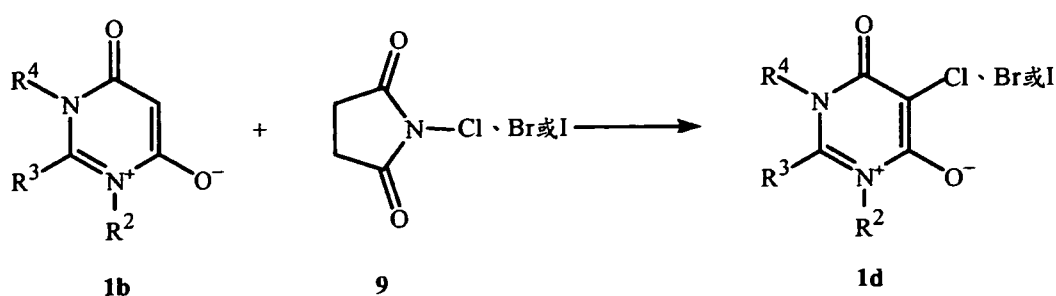
如流程 13 中所示，可藉由菌頭偶合反應 (Sonogashira coupling reaction) 自式 1d 化合物 (亦即， R^1 為 Cl、Br 或 I 之式 1a) 及式 8 之經取代炔製備 R^1 為 C_2-C_6 炔基、 C_2-C_6 鹵炔基或 $C\equiv CR^{10}$ 之式 1a 化合物。菌頭偶合在文獻中熟知。參見例如 K. Sonogashira, *Sonogashira Alkyne Synthesis* 第 2 卷，第 493 頁，E. Negishi, *Handbook of Organopalladium Chemistry for Organic Synthesis*, Wiley-Interscience, 2002, New York, New York。

流程 13



如流程 14 中所示，式 1d 化合物可自式 1b 化合物藉由使用 (例如) 液體溴或 *N*-鹵代琥珀醯亞胺 (9) 鹵化製備。該反應通常在惰性溶劑中、更通常在鹵化溶劑 (諸如，二氯甲烷或 1,2-二氯乙烷) 中進行。反應通常在 0°C 至 80°C 之溫度下、更通常在周圍溫度下進行。

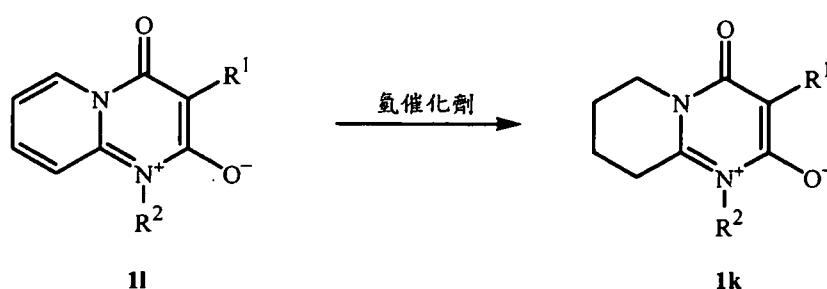
流程 14



如流程 15 中所示，可自式 11 化合物 (亦即， R^3 與 R^4 一起形

成Z為CH=CH之視情況經取代之芳環R-2的式1a)藉由在鉑族金屬或金屬氧化物催化劑存在下使用氫還原來製備式1k化合物(亦即，R³與R⁴一起形成m為2之視情況經取代之碳環R-1的式1a)。鉑族金屬通常為鉑或鈀或其氧化物且還原係在惰性溶劑中進行(參見例如Kappe, Thomas等人, *Heterocycles* 1995, 40, 681-9)。合適溶劑包括(但不限於)甲醇、乙醇、四氫呋喃及甲基第三丁基醚。反應通常在周圍溫度及約100 kPa壓力下進行。

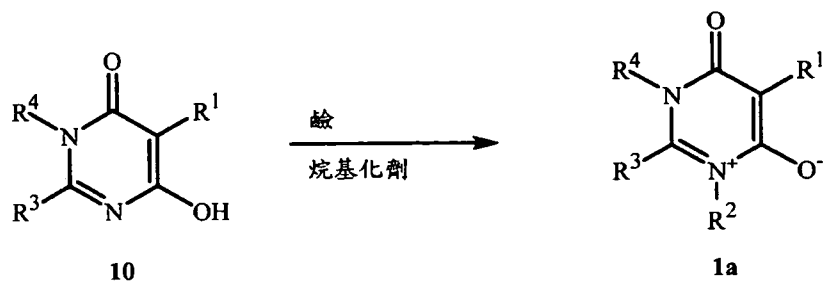
流程 15



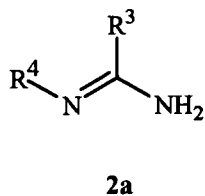
式1l化合物可藉由流程1至5中所示之方法自式2化合物(其中R³及R⁴與相鄰連接之氮及碳原子一起形成環R-1且Z為CH=CH)製備。

如流程16中所示，式1a化合物亦可藉由使用適當經取代之烷基化劑及鹼(諸如，碳酸鉀)使式10化合物烷基化來製備(參見例如Kappe, T.等人, *Monatshefte für Chemie* 1971, 102, 412-424及Urban, M. G.、Arnold, W. *Helvetica Chimica Acta* 1970, 53, 905-922)。烷基化劑包括(但不限於)烷基氯化物、溴化物、碘化物及磺酸酯。多種鹼及溶劑可用於流程16之方法中，且此等鹼及溶劑在此項技術中熟知。

流程 16

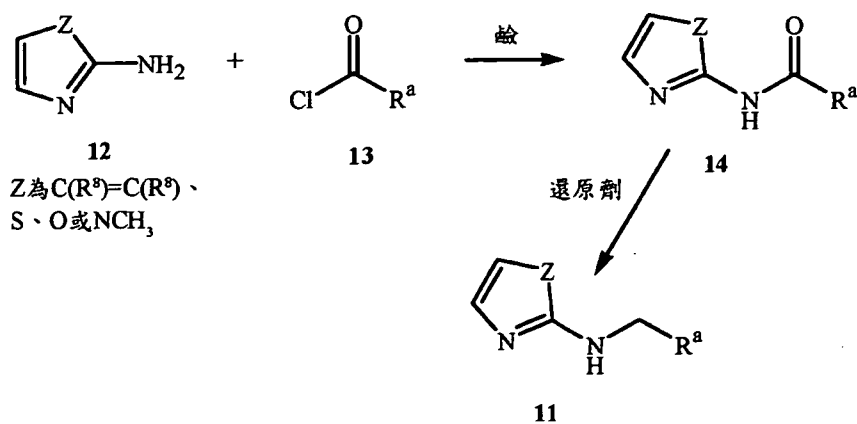


式 10 化合物可藉由類似於流程 1 至 5 中所示方法之方法自式 2a 化合物製備。式 2a 化合物可購得或可藉由此項技術中熟知之通用方法製備。



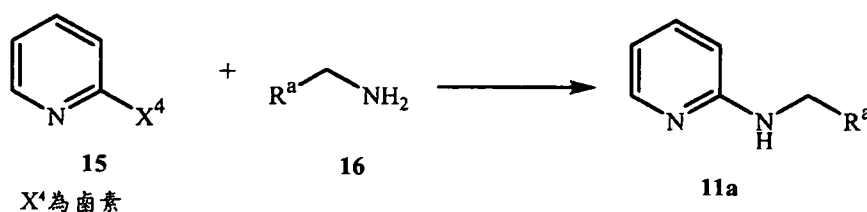
熟習此項技術者應瞭解 R^3 與 R^4 一起形成環 R-2 且 R^a 為含有末端 CH_2 基團之 R^2 取代基之子集的式 2 化合物可藉由此項技術中熟知之通用方法製備。舉例而言，流程 17 說明一種方法，其中在合適之鹼存在下用式 13 化合物使式 12 化合物醯化。將所得式 14 之中間物用合適試劑(諸如，二硼烷)還原以提供式 11 化合物。

流程 17



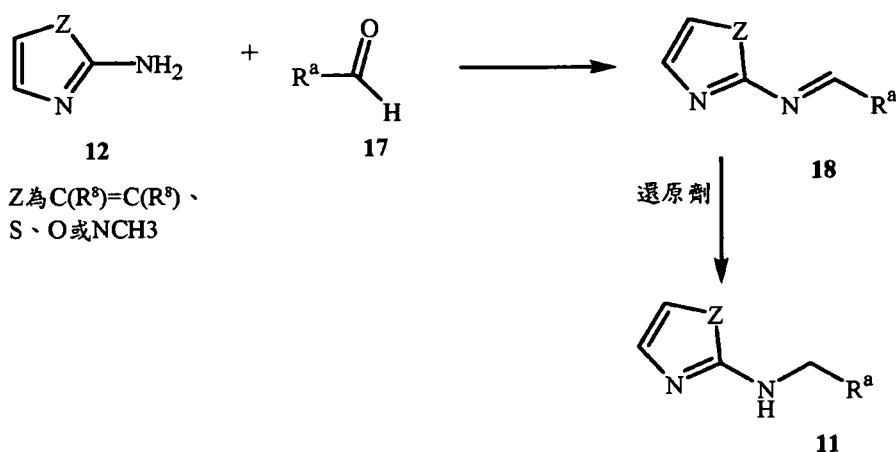
如流程18中所示，式11a化合物(Z為CH=CH之式11化合物)可藉由式15之 α -鹵代吡啶化合物經合適的式16之胺的直接置換反應來製備。適用於流程18之方法中的 α -鹵代吡啶化合物之實例包括(但不限於)2-氟吡啶及2-氯吡啶。合適胺之實例包括(但不限於)2,2,2-三氟乙胺及5-胺基甲基-2-氯吡啶。該反應通常在惰性溶劑中、更通常在極性溶劑(諸如，*N,N*-二甲基乙醯胺或1-甲基-2-吡咯啉酮)中進行。反應通常在0°C至180°C、更通常在周圍溫度至150°C之溫度下進行。

流程 18



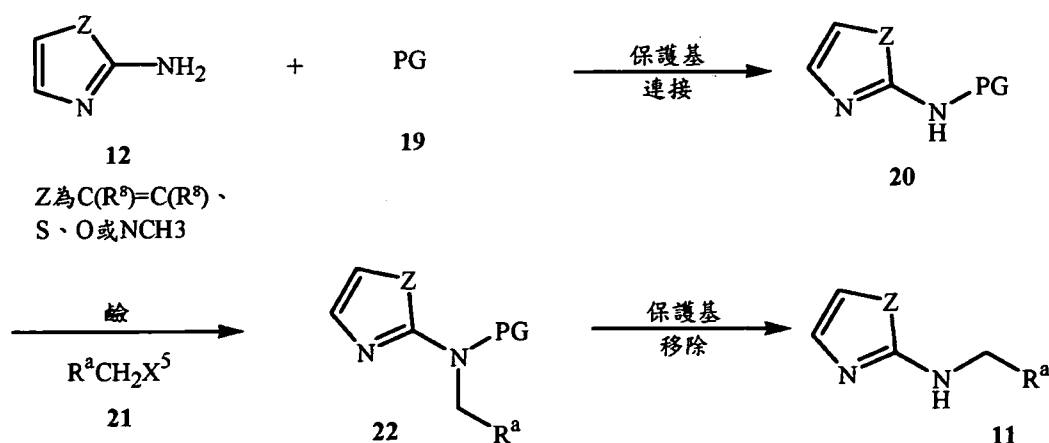
式11化合物可藉由式12之胺與合適的式17之醛之間的還原胺化反應來製備。此等反應以一鍋式反應或如流程19中所示，藉由逐步反應經由式18之亞胺中間物進行。適用於流程19之方法中的胺化合物之實例包括(但不限於)2-胺基吡啶及2-胺基噻唑。流程19之方法中的合適醛之實例包括(但不限於)6-氯菸醛。流程19之方法中的合適還原劑之實例包括(但不限於)硼氫化鈉、硼氫化鋅及氰基硼氫化鈉。用於還原胺化反應之通用方法及程序在文獻中熟知；參見例如 Abdel-Magid 等人，*J. Org. Chem.* 1996, 61(11), 3849-3862。

流程 19



用於製備式 11 化合物之一替代方法展示於流程 20 中。在流程 20 之方法中，將式 12 化合物用合適保護基 (諸如 (但不限於) 第三丁氧基羰基、乙醯基或甲醯基) 保護以形成 PG 為保護基之式 20 之中間物。接著將式 20 化合物用合適的式 21 之試劑 (其中 R^a 為含有末端 CH₂ 基團之 R² 取代基之子集且 X⁵ 為離去基，諸如鹵素) 烷基化以產生式 22 之中間物。將保護基移除以提供式 11 化合物。胺官能基上保護基形成及移除之條件在文獻中已知 (參見例如 Greene, T. W.、Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 第 2 版; Wiley: New York, 1991)。

流程 20



X及/或Y為S之式1化合物可自相應式1a化合物藉由此項技術中已知之通用方法，包含用硫化試劑(諸如， P_4S_{10} 或勞文森試劑(Lawesson's Reagent)(2,4-雙-(4-甲氧基苯基)-1,3-二硫雜-2,4-二磷烷2,4-二硫化物))處理來製備。

流程1至20說明製備具有針對 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 指明之多個取代基的式1化合物的方法。具有除針對流程1至20特別指明之彼等取代基外的 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 取代基之式1化合物可藉由合成有機化學之技術中已知之通用方法，包括類似於針對流程1至20所述之彼等方法之方法製備。

認識到上述用於製備式1化合物之某些試劑及反應條件可能與中間物中所存在之某些官能基不相容。在此等情況下，將保護/去保護順序或官能基相互轉化併入合成中將有助於獲得所需產物。保護基之使用及選擇對熟習化學合成者而言將顯而易見(參見例如Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 第2版; Wiley: New York, 1991)。熟習此項技術者將認識到在一些狀況下在如任何個別流程中描繪引入所給試劑後，可能需要進行未詳細描述之其他常規合成步驟以完成式1化合物之合成。熟習此項技術者亦將認識到可能需要以不同於為製備式1化合物而呈現之特定順序所表示之次序的次序進行以上流程中所說明之步驟的組合。

熟習此項技術者亦將認識到式1化合物及本文所述之中間物可進行各種親電、親核、自由基、有機金屬、氧化及還原反應以添加取代基或改變現有取代基。

不作另外詳細描述，咸信熟習此項技術者使用前述描述可最大程度地利用本發明。因此，以下合成實例應理解為僅具說明性且決不以任何方式限制本揭示案。以下合成實例中之步驟說明總合成轉化中各步驟之程序，且各步驟之起始物質可能未必藉由程序在其他實例或步驟中予以描述之特定製備過程製備。周圍溫度或室溫係定義為約20-25°C。除層析溶劑混合物或另外指示外，百分比係以重量計。除非另外指示，否則層析溶劑混合物之份數及百分比係以體積計。¹H NMR譜係以自四甲基矽烷之低場ppm報導；「s」意謂單峰，「d」意謂二重峰，「dd」意謂雙二重峰，「ddd」意謂雙二重峰之雙重峰，「t」意謂三重峰，「m」意謂多重峰，且「br s」意謂寬單峰。對於質譜數據而言，所報導之數值為藉由添加H⁺(分子量為1)至分子(M)中以產生藉由質譜分析使用大氣壓力化學電離(AP⁺)觀測到之M+1峰而形成的母分子離子之分子量。

合成實例 1

2-羥基-4-側氧基-3-苯基-1-(2,2,2-三氟乙基)-4H-吡啶并[1,2-a]-嘓啶鎗內鹽之製備

將苯基丙二酸二乙酯(0.62 g, 2.7 mmol)與N-(2,2,2-三氟乙基)-2-吡啶胺(0.87 g, 2.7 mmol, 藉由Bissell, E. R.; Swanslger, R. W. *J. Chem. Eng. Data.* 1981, 26, 234-235之方法製備)之混合物加熱至180°C，歷時2 h。冷卻後，藉由矽膠層析以乙酸乙酯溶離純化反應混合物以提供呈黃色固體狀之標題化合物(化合物編號7)(45 mg)，一種本發明之

化合物。

^1H NMR (CDCl_3) δ 9.61 (dd, 1H), 8.17 (ddd, 1H), 7.74 (d, 2H), 7.55 (d, 1H), 7.45 (t, 1H), 7.39 (m, 2H), 7.21-7.25 (m, 1H), 5.10 (br s, 2H)。

合成實例 2

1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]-嘧啶鎊內鹽及1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-3-(2,2,2-三氟乙醯基)-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎊內鹽之製備

步驟 A：*N*-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-*N*-2-吡啶基胺基甲酸 1,1-二甲基乙酯(或者稱為(2-氯噻唑-5-基甲基)吡啶-2-基-胺基甲酸第三丁酯)之製備

將礦物油中之氫化鈉(60%, 2.22 g, 55.6 mmol)逐份添加至在冰/水浴中冷卻至0°C之圓底燒瓶中*N*-2-吡啶基胺基甲酸 1,1-二甲基乙酯(9.0 g, 46.3 mmol, 藉由 Krein, D. M., Lowary, T. L. *J. Org. Chem.* 2002, 67, 4965-4967之方法製備)於*N,N*-二甲基甲醯胺(40 mL)中之溶液中。將懸浮液再強力攪拌 30 min, 接著添加 2-氯-5-(氯甲基)噻唑(7.4 g, 55.6 mmol)。將反應混合物逐漸溫至室溫且攪拌 16-24 h。接著添加水(200 mL), 且將反應混合物以 50 mL 乙酸乙酯萃取 3 次。將組合之有機萃取物用 20 mL 水洗滌 4 次, 經 Na_2SO_4 乾燥, 且在減壓下濃縮。藉由矽膠層析以乙酸乙酯/己烷溶離純化所得殘餘物以提供呈琥珀色油狀之標題化合物(9.3 g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 8.40 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.64 (t, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.03 (t, 1H), 5.18 (s, 2H), 1.54 (s, 9 H)。

步驟 B：N-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-吡啶胺(或者稱為(2-氯噻唑-5-基甲基)-吡啶-2-基-胺)之製備

將三氟乙酸(13.2 mL, 171 mmol)添加至圓底燒瓶中N-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-N-2-吡啶基胺基甲酸1,1-二甲基乙酯(亦即，步驟A之產物)(9.3 g, 28.5 mmol)於二氯甲烷:水(60 mL:8 mL)中之溶液中，且將混合物攪拌66 h。接著將反應混合物冷卻至 0°C 且用3 M NaOH中和至約pH 12，接著以100 mL乙酸乙酯萃取2次。將有機層組合，經 Na_2SO_4 乾燥且在減壓下濃縮以提供呈褐色固體狀之標題化合物(5.0 g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 8.19 (d, 1H), 7.43 (m, 2H), 7.65 (t, 1H), 6.42 (d, 1H), 4.80 (s, NH), 4.67 (d, 2H)。

步驟 C：1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羧基-4-側氧基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎂內鹽之製備

將二環己基碳化二亞胺溶液(1.0 M於二氯甲烷中, 26.6 mL, 26.6 mmol)添加至圓底燒瓶中N-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-吡啶胺(亦即，步驟B之產物)(3.0 g, 13.3 mmol)及丙二酸(1.38 g, 13.3 mmol)於二氯甲烷(30 mL)中之溶液中。將反應混合物在室溫下攪拌16-24 h。接著經由Celite®矽藻土助濾劑墊過濾反應混合物，且將濾餅用二氯甲烷洗滌。將組合之有機相在減壓下濃縮，且藉由矽膠層析以乙酸乙酯/己烷溶離純化所得殘餘物以提供呈淺黃色固體狀之標題

化合物(化合物編號125)(2.90 g)，一種本發明之化合物。

$^1\text{H NMR}$ ($\text{CD}_3\text{S}(\text{O})\text{CD}_3$) δ 9.20 (d, 1H), 8.36 (t, 1H), 8.11 (d, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.52 (t, 1H), 5.56 (s, 2H), 4.98 (s, 1H)。

步驟D：1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-3-(2,2,2-三氟乙醯基)-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎊內鹽之製備

將1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎊內鹽(亦即，步驟C之產物)(300 mg, 1.02 mmol)、1,4-二氮二環[2.2.2]辛烷(11.5 mg, 0.102 mmol)及三氟乙酸酐(0.14 mL, 1.02 mmol)溶於*N*-甲基-2-吡咯啉酮(3 mL)中，且將反應混合物在室溫下攪拌1 h。將混合物用二氯甲烷(30 mL)稀釋，用水(10 mL)、飽和碳酸氫鈉水溶液(10 mL)及水(10 mL×4次)洗滌，濃縮且用乙醚濕磨以產生呈固體狀之標題化合物(化合物編號702)，一種本發明之化合物。

$^1\text{H NMR}$ (CD_3COCD_3) δ 9.38 (d, 1H), 8.58 (t, 1H), 8.22 (d, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.70 (t, 1H), 5.71 (br s, 2H)。

合成實例3

1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-3-[2-氯-5-(三氟甲氧基)苯基]-2-羥基-4-側氧基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎊內鹽、1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎊內鹽及1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-羥基-3-碘-4-側氧基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎊內鹽之製備

步驟A：6-氯-*N*-2-吡啶基-3-吡啶甲胺之製備

將2-氯吡啶(1.4 g, 15 mmol)與6-氯-3-吡啶甲胺(或者稱為5-氨基甲基-2-氯吡啶)(2.55 g, 18 mmol)於N-甲基吡咯啉酮(5 mL)中之混合物在微波反應器中於230°C下加熱30 min。將此反應重複4次，每次重複使用相同量之起始物質。接著將所有5份反應混合物傾倒至飽和碳酸氫鈉水溶液中且萃取至乙酸乙酯中。將有機層用飽和碳酸氫鈉水溶液洗滌，經Na₂SO₄乾燥且在減壓下濃縮。接著藉由矽膠層析使用己烷中10%乙酸乙酯作為溶離劑純化粗產物以提供呈油狀之標題化合物(5.1 g)。

¹H NMR (CDCl₃) δ 8.38 (s, 1H), 8.1 (m, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.42 (dd, 1H), 7.28 (d, 1H), 6.63 (m, 1H), 6.38 (d, 1H), 4.88 (s, 1H), 4.56 (d, 2H)。

步驟B：1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎗內鹽之製備

將二環己基碳化二亞胺溶液(4.12 g, 20 mmol於10 mL二氯甲烷中)添加至圓底燒瓶中6-氯-N-2-吡啶基-3-吡啶甲胺(亦即，步驟A之產物)(2.19 g, 10 mmol)及丙二酸(1.04 g, 10 mmol)於二氯甲烷(10 mL)中之溶液中。將反應混合物在室溫下攪拌16-24 h。接著將反應混合物過濾且用乙醚洗滌濾餅。將濾液在減壓下濃縮，且用甲醇洗滌所得殘餘物以提供呈淺黃色固體狀之標題化合物(化合物編號611)(2.54 g)，一種本發明之化合物。

¹H NMR (丙酮-d₆) δ 9.32 (d, 1H), 8.52 (s, 1H), 8.29 (dd, 1H), 7.79 (m, 2H), 7.52 (t, 1H), 7.42 (d, 1H), 5.63 (s, 2H),

5.03 (s, 1H)。

步驟 C：1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-羥基-3-碘-4-側氧基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎗內鹽之製備

將 N-碘代琥珀醯亞胺 (1.12 g, 5 mmol) 添加至 1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎗內鹽 (亦即，步驟 B 之產物) (1.4 g, 5 mmol) 於 *N,N*-二甲基甲醯胺 (10 mL) 中之溶液中且攪拌 5 min。添加水且用二氯甲烷萃取混合物。將組合之有機相用水重複洗滌，經 Na_2SO_4 乾燥且在減壓下濃縮。所得粗產物 (化合物編號 118) (一種本發明之化合物) (1.8 g) 未經進一步純化而用於下一步中。

^1H NMR (CDCl_3) δ 9.49 (d, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.12 (dd, 1H), 7.40 (m, 2H), 7.32 (d, 1H), 5.50 (s, 2H)。

步驟 D：1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-3-[2-氟-5-(三氟甲氧基)苯基]-2-羥基-4-側氧基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎗內鹽之製備

將 1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-羥基-3-碘-4-側氧基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎗內鹽 (亦即，步驟 C 之產物) (206 mg, 0.5 mmol)、2-氟-5-(三氟甲氧基)苯酸 (224 mg, 1 mmol) 及雙(三苯基膦基)二氯化鈹 (35 mg, 0.005 mmol) 溶於二噁烷 (2 mL) 中。添加碳酸鈉水溶液 (2 N, 1 mL)，且將反應混合物在微波反應器中於 160°C 下加熱 10 min。將冷卻之反應混合物直接傾倒至矽膠管柱上且依次以己烷、己烷中之 30% 乙酸乙酯、己烷中之 50% 乙酸乙酯及最後之乙酸乙酯溶離以產生呈固體狀之標題化合物 (化合物編號 58) (20 mg)，一種

本發明之化合物。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 9.53 (d, 1H), 8.49 (s, 1H), 8.11 (dd, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.41 (m, 2H), 7.34 (d, 1H), 7.16 (d, 2 H), 7.58 (br s, 2H)。

合成實例 4

2-羥基-4-側氧基-3-苯基-1-(2-丙烯-1-基)-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎊內鹽之製備

將 *N*-2-丙烯-1-基-2-吡啶胺 (670 mg, 5 mmol) 及 2-苯基丙二酸 1,3-雙(2,4,6-三氯苯基)酯 (3.0 g, 6 mmol) 溶於二噁烷 (3 mL) 中且在 60°C 下加熱 15 min。接著將反應混合物傾倒至矽膠管柱上，以己烷中之 50% 乙酸乙酯溶離以提供呈固體狀之標題化合物 (化合物編號 122)，一種本發明之化合物。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 9.52 (d, 1H), 8.04 (dd, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.2-7.45 (m, 6H), 5.95 (m, 1H), 5.34 (d, 1H), 5.30 (d, 1H), 5.01 (d, 2H)。

合成實例 5

2-羥基-4-側氧基-3-苯基-1-(2,2,2-三氟乙基)-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]-嘧啶鎊內鹽之製備

步驟 A：N-(2,2,2-三氟乙基)-2-吡啶胺之製備

將 2-氟吡啶 (2.00 g, 20.6 mmol) 與 2,2,2-三氟乙胺鹽酸鹽 (5.00 g, 36.9 mmol) 之混合物在微波反應器中加熱至 220°C，歷時 30 min。相同反應重複 5 次。將來自所有 6 次反應之反應混合物冷卻，組合且用乙酸乙酯 (150 mL) 稀釋。藉由用飽和碳酸氫鈉水溶液、水 (30 mL) 及鹽水 (30 mL) 洗

滌，將有機混合物中和。將有機相經 Na_2SO_4 乾燥且濃縮，且藉由矽膠層析使用80%乙酸乙酯/己烷作為溶離劑純化所得殘餘物，以產生呈白色固體狀之標題化合物(17.0 g)。

^1H NMR (CDCl_3) δ 8.15 (d, 1H), 7.45 (dd, 1H), 6.69 (dd, 1H), 6.49 (d, 1H), 4.58 (br s, 1H), 4.11 (q, 2H)。

步驟B：2-苯基丙二酸1,3-雙(2,4,6-三氯苯基)酯之製備

在室溫下向苯基丙二酸(5.00 g, 27.8 mmol)於二氯甲烷(7 mL)中之漿液中添加一滴*N,N*-二甲基甲醯胺，接著以保持氣體溢出在控制之下的速率逐滴添加乙二醯氯(9.09 g, 71.6 mmol)。將反應混合物在室溫下再攪拌1小時，在此期間反應混合物澄清。添加2,4,6-三氯苯酚(15 g, 76 mmol)，且將反應混合物在室溫下攪拌18 h。將反應混合物在真空下濃縮，且將甲醇(100 mL)添加至殘餘物中，由此使得大量固體沈澱。藉由過濾收集固體，將其用甲醇(80 mL)沖洗，且經空氣乾燥以產生呈白色固體狀之標題產物(13 g)。

^1H NMR (CDCl_3) δ 7.64-7.62 (m, 2H), 7.46-7.43 (m, 3H), 7.36 (s, 4H), 5.32 (s, 1H)。

步驟C：2-羥基-4-側氧基-3-苯基-1-(2,2,2-三氯乙基)-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]-嘓啶鎗內鹽之製備

將*N*-(2,2,2-三氯乙基)-2-吡啶胺(亦即，步驟A之產物)(2.00 g, 11.4 mmol)及2-苯基丙二酸1,3-雙(2,4,6-三氯苯基)酯(亦即，步驟B之產物)(6.40 g, 11.9 mmol)於甲苯(40 mL)中之溶液回流1 h。將反應混合物在冰水浴中在攪拌下

冷卻 2 h。藉由過濾收集沈澱之固體，將其用乙醚沖洗且經空氣乾燥以產生呈黃色固體狀之標題化合物(化合物編號 7)(3.44 g)，一種本發明之化合物。

^1H NMR ($\text{CD}_3\text{S}(\text{O})\text{CD}_3$) δ 9.37 (d, 1H), 8.42 (m, 1H), 8.11 (d, 1H), 7.66 (d, 2H), 7.61 (m, 1H), 7.32 (t, 2H), 7.18 (t, 1H), 5.35 (q, 2H)。

合成實例 6

8-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-7-羥基-5-側氧基-6-[3-(三氟甲氧基)苯基]-5*H*-噻唑并[3,2-*a*]嘧啶鎊內鹽之製備

步驟 A：N-[(6-氯-3-吡啶基)亞甲基]-2-噻唑胺之製備

在室溫下將 2-胺基噻唑(0.75 g, 7.5 mmol)添加至二氯甲烷(25 mL)中之 2-氯吡啶-5-甲醛(1.0 g, 7.1 mmol)中。將懸浮液再攪拌 10 min 且接著在真空下濃縮至乾燥。將所得殘餘物在具有單向凸起疏水器(non-returning bump trap)之旋轉蒸發器上加熱至 90°C 以便於移除水。30 min 後，藉由 NMR 檢查所得黃色固體以驗證反應完成(根據在 10.10 ppm(s, 1H)處之特徵性醛峰消失)。獲得呈黃色固體狀之標題化合物(1.55 g)且其未經進一步純化而用於下一步中。

^1H NMR (CDCl_3) δ 9.10 (s, 1H), 8.84 (d, 1H), 8.35-8.32 (dd, 1H), 7.72-7.70 (d, 1H), 7.48-7.46 (d, 1H), 7.32-7.31 (d, 1H)。

步驟 B：6-氯-N-2-噻唑基-3-吡啶甲胺之製備

將 N-[(6-氯-3-吡啶基)亞甲基]-2-噻唑胺(亦即，步驟 A 之產物)(0.55 g, 2.46 mmol)逐份添加至甲醇(30 mL)中經攪拌

之過量硼氫化鈉(0.45 g, 11.8 mmol)中。在添加亞胺期間添加額外份之硼氫化鈉(2×1當量)以維持放熱反應。添加完成後，使反應混合物在周圍溫度下攪拌5 min。藉由添加冰醋酸直至氣體溢出停止來使過量還原劑停止反應。將澄清反應混合物濃縮且使所得殘餘物在飽和碳酸鈉水溶液與乙酸乙酯之間分溶。將水相以乙酸乙酯(3×30 mL)萃取，且將組合之有機相用鹽水洗滌，乾燥(MgSO₄)且濃縮以產生呈褐色粉末狀之標題化合物(0.55 g)。

¹H NMR (CDCl₃) δ 8.39 (d, 1H), 7.71-7.68 (dd, 1H), 7.30-7.28 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 6.48 (d, 1H), 4.48 (s, 2H)。

步驟C：2-[3-(三氟甲氧基)苯基]丙二酸之製備

將3-三氟甲氧基苯基丙二酸二乙酯(3.00 g, 9.38 mmol)在氫氧化鈉水溶液(15 g, 20重量%)中於65°C下攪拌10 min。接著將反應混合物在冰浴中冷卻，且將冰(7 g)添加至反應混合物中，接著添加6 N鹽酸以將pH值調至約2。用氯化鈉使水性混合物飽和且將其以乙酸乙酯萃取3次。將組合之有機相乾燥(MgSO₄)且濃縮以產生固體，將固體用33%乙醚/己烷之混合物濕磨以產生呈白色固體狀之標題化合物(2.24 g)。

¹H NMR (CD₃C(O)CD₃) δ 11.51 (br s, 2H), 7.54-7.51 (m, 3H), 7.35-7.30 (m, 1H), 4.91 (s, 1H)。

步驟D：8-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-7-羥基-5-側氧基-6-[3-(三氟甲氧基)苯基]-5H-噻唑并[3,2-a]嘧啶鎊內鹽之製備

在周圍溫度下將乙二醯氯(1.0 mL, 11 mmol)逐滴添加至2-[3-(三氟甲氧基)苯基]丙二酸(亦即, 步驟C之產物)(0.17 g, 0.66 mmol)於含有催化量之*N,N*-二甲基甲醯胺之二氯甲烷(0.2 mL)中的漿液中。將反應混合物再攪拌10 min, 在此期間氣體停止溢出。將反應混合物在周圍溫度下在真空下簡單濃縮。將所得油狀物溶解於二氯甲烷(2 mL)中且添加至0°C下6-氯-*N*-2-噻唑基-3-吡啶甲胺(亦即, 步驟B之產物)(0.23 g, 1.02 mmol)及三乙胺(0.40 g, 3.37 mmol)於二氯甲烷(4 mL)中之溶液中。攪拌15 min後, 濃縮反應混合物, 且藉由矽膠層析使用50-100%乙酸乙酯/己烷作為溶離劑純化所得殘餘物以產生呈固體狀之標題化合物(化合物編號138)(0.19 g), 一種本發明之化合物。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 8.50 (s, 1H), 8.25 (d, 1H), 7.87 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.41-7.35 (m, 2H), 7.08 (d, 1H), 7.03 (d, 1H), 5.29 (s, 2H)。

合成實例 7

2-羥基-4-側氧基-1-丙基-3-[2-(三氟甲基)苯基]-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]-嘓啶鎊內鹽及2-羥基-4-側氧基-1-丙基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]-嘓啶鎊內鹽之製備

步驟 A: 2-羥基-4-側氧基-1-丙基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]-嘓啶鎊內鹽之製備

將二環己基碳化二亞胺溶液(15.63 g於45 mL二氯甲烷中, 75.76 mmol)添加至*N*-丙基-2-胺基吡啶(5.16 g, 37.8 mmol)及丙二酸(3.94 g, 37.8 mmol)於二氯甲烷(90 mL)中

之溶液中。將反應混合物在室溫下攪拌 24 h。接著經由 Celite® 墊過濾反應混合物，且將濾餅用二氯甲烷洗滌。濃縮組合之有機相，且藉由矽膠層析使用 50-100% 乙酸乙酯/己烷作為溶離劑純化所得殘餘物以產生呈淺黃色固體狀之標題化合物(化合物編號 609)(5.60 g)，一種本發明之化合物。

^1H NMR (CDCl_3) δ 9.40 (d, 1H), 8.15 (t, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.30 (t, 1H), 5.38 (s, 1H), 4.24 (t, 2H), 1.88 (m, 2H), 1.06 (t, 3H)。

步驟 B：2-羥基-4-側氧基-1-丙基-3-[2-(三氟甲基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]-嘓啶鎗內鹽之製備

將 2-羥基-4-側氧基-1-丙基-4H-吡啶并[1,2-a]嘓啶鎗內鹽(亦即，步驟 A 之產物)(500 mg, 2.45 mmol)、1-碘-2-(三氟甲基)苯(0.34 mL, 2.45 mmol)、碘化亞銅(46.6 mg, 0.245 mmol)、1,10-菲啉(44.1 mg, 0.245 mmol)及碳酸鈉(798 mg, 2.45 mmol)組合於 *N,N*-二甲基甲醯胺(3 mL)中。將反應混合物在氮下在 118°C 下加熱 24 h。將反應混合物冷卻且濃縮，且藉由於 XTerra® C18 OBD 管柱(5 微米粒子，30×100 mm，由 Waters 製造)上逆相液相層析使用 30-90%(1:1 乙腈/甲醇)/水之梯度純化所得殘餘物以提供呈固體狀之標題化合物(化合物編號 308)(20 mg)，一種本發明之化合物。

^1H NMR (CDCl_3) δ 9.44 (d, 1H); 8.13 (t, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.58 (t, 1H), 7.42-7.52 (m, 3H), 7.35 (t, 1H), 4.42-4.35 (m, 1H), 4.24-4.18 (m, 1H), 1.80 (q, 2H), 1.05 (t, 3H)。

合成實例 8

2-羥基-3-碘-1-[[2-(3-甲氧基苯基)-5-噻唑基]甲基]-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]-嘧啶鎗內鹽之製備

步驟 A：1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-3-碘-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]-嘧啶鎗內鹽之製備

將 *N*-碘代琥珀醯亞胺 (2.19 g, 9.76 mmol) 添加至 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎗內鹽 (亦即，實例 2 步驟 C 之產物) (2.9 g, 9.76 mmol) 於 *N,N*-二甲基甲醯胺 (30 mL) 中之溶液中，且將混合物攪拌 5 min。添加水且以乙酸乙酯萃取混合物。將組合之有機相用水洗滌數次，經 Na₂SO₄ 乾燥且在減壓下濃縮。所得粗產物 (化合物編號 608) (1.2 g) (一種本發明之化合物) 未經進一步純化而用於下一步中。

¹H NMR (CD₃COCD₃) δ 9.36 (d, 1H), 8.45 (t, 1H), 8.20 (d, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.58 (t, 1H), 5.77 (s, 2H)。

步驟 B：2-羥基-3-碘-1-[[2-(3-甲氧基苯基)-5-噻唑基]甲基]-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]-嘧啶鎗內鹽之製備

將 1-[(2-氯-5-噻唑基)甲基]-2-羥基-3-碘-4-側氧基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]-嘧啶鎗內鹽 (亦即，步驟 A 之產物) (250 mg, 0.59 mmol)、3-甲氧基苯酸 (89 mg, 0.59 mmol) 及雙(三苯基膦)-二氯化鈹(II) (20 mg, 0.029 mmol) 溶於二噁烷 (3 mL) 中。添加碳酸鈉水溶液 (2 N, 1 mL) 且將反應混合物在微波反應器中於 150°C 下加熱 15 min。將冷卻之反應混合物直接傾倒至矽膠管柱上且依次以己烷、己烷中之 30% 乙酸乙

酯、己烷中之50%乙酸乙酯及最後之乙酸乙酯溶離以產生呈固體狀之標題化合物(化合物編號613)(35 mg)，一種本發明之化合物。

$^1\text{H NMR}$ (CD_3COCD_3) δ 9.38 (d, 1H), 8.43 (t, 1H), 8.20 (d, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.58 (t, 1H), 7.50 (m, 2H), 7.39 (t, 1H), 7.02 (d, 1H), 5.88 (br s, 2H), 3.86 (s, 3H)。

合成實例9

2-羥基-4-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-3-[2,2,2-三氟-1-(甲氧基亞胺基)乙基]-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]-嘧啶鎬內鹽、2-羥基-4-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]-嘧啶鎬內鹽及2-羥基-4-側氧基-3-(2,2,2-三氟乙基)-1-(2,2,2-三氟乙基)-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]-嘧啶鎬內鹽之製備

步驟A：2-羥基-4-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]-嘧啶鎬內鹽之製備

將二環己基碳化二亞胺溶液(1.0 M於二氯甲烷中，108 mL, 108 mmol)添加至*N*-(2,2,2-三氟乙基)-2-吡啶胺(即實例5步驟A之產物)(9.51 g, 54.0 mmol)及丙二酸(5.62 g, 54.0 mmol)於二氯甲烷(190 mL)中之溶液中。反應混合物在室溫下攪拌24 h。接著反應混合物經由Celite®墊過濾，濾餅用二氯甲烷洗。在減壓下濃縮合併之有機相，所得殘餘物藉由矽膠層析使用50-100%乙酸乙酯/己烷作為溶離劑純化以產生呈淺黃色固體之標題化合物(化合物編號610)(7.0 g)，一種本發明之化合物。

$^1\text{H NMR}$ ($\text{CD}_3\text{S(O)CD}_3$) δ 9.22 (d, 1H), 8.42 (t, 1H), 8.11

(d, 1H), 7.59 (t, 1H), 5.25 (q, 2H), 4.96 (s, 1H)。

步驟 B：2-羥基-4-側氧基-3-(2,2,2-三氟乙醯基)-1-(2,2,2-三氟乙基)-4H-吡啶并[1,2-a]-嘓啶鎊內鹽之製備

將2-羥基-4-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-4H-吡啶并[1,2-a]-嘓啶鎊內鹽(即步驟A之產物)(1.12 g, 4.57 mmol)、1,4-二氮二環[2.2.2]辛烷(132.0 mg, 1.12 mmol)及三氟乙酸酐(1.50 mL, 10.92 mmol)溶於1-甲基-2-吡咯啶酮(10 mL)中，反應混合物在室溫下攪拌18 h。混合物用乙酸乙酯(250 mL)稀釋，用飽和碳酸氫鈉水溶液(150 mL)、水(3×100 mL)洗，且濃縮。殘餘物用乙醚濕磨以產生呈固體之標題化合物(化合物編號711)(1.10 g)，一種本發明之化合物。

$^1\text{H NMR}$ ($\text{CD}_3\text{S}(\text{O})\text{CD}_3$) δ 9.25 (d, 1H), 8.58 (t, 1H), 8.10 (d, 1H), 7.65 (t, 1H), 5.25 (q, 2H)。

步驟 C：2-羥基-4-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-3-[2,2,2-三氟-1-(甲氧基亞胺基)乙基]-4H-吡啶并[1,2-a]-嘓啶鎊內鹽之製備

將2-羥基-4-側氧基-3-(2,2,2-三氟乙醯基)-1-(2,2,2-三氟乙基)-4H-吡啶并[1,2-a]-嘓啶鎊內鹽(亦即，步驟B之產物)(75 mg, 0.22 mmol)及甲氧基胺鹽酸鹽(62 mg, 0.74 mmol)於乙醇(7 mL)中之溶液回流3 h。將溶劑在真空下濃縮，且添加乙酸乙酯(60 mL)。將有機相依次用稀氫氧化鈉溶液(3 mL 1 N NaOH及30 mL水)及水(20 mL)洗滌。接著經由預先填充Celite®之Chem Elut™濾筒(由Varian製造)過濾有機相且濃縮成粗油狀物。藉由於Analtech

UniplatTM(20×20 cm, 2000微米矽膠層)上之製備型薄層層析以乙酸乙酯溶離純化所得殘餘物以提供呈稠油狀之標題化合物(化合物編號637)(53 mg, E與Z異構體之1:1混合物), 一種本發明之化合物。

¹H NMR (CDCl₃) δ 9.49 (d, 0.5H), 9.47 (d, 0.5H), 8.23 (t, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.50 (m, 1H), 5.00 (m, 2H), 4.10 (s, 1.5H), 4.04 (s, 1.5H)。

合成實例 10

1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-4-羥基-2-亞胺基-3-(2-甲氧基苯基)-2H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎂內鹽之製備

步驟 A: α-氯基-2-甲氧基苯乙酸苯酯之製備

在室溫下向氫化鈉(3.39 g 60%於礦物油中, 84.9 mmol)於四氫呋喃(200 mL)中之漿液中逐滴添加2-(2-甲氧基苯基)乙腈(10.0 g, 67.9 mmol)。接著將反應混合物加熱至回流且灰色懸浮液經30 min變成深紅色。逐份添加碳酸二苯酯(18.2 g, 84.9 mmol), 且將反應懸浮液在回流下再加熱18 h。將反應混合物冷卻, 傾倒至1 N HCl(200 mL)中, 且以乙酸乙酯(3×200 mL)萃取。將有機相組合, 經硫酸鎂乾燥, 在減壓下在Celite®上過濾且濃縮。藉由矽膠層析使用10-90%乙酸乙酯/己烷作為溶離劑純化所得殘餘物以產生呈淡黃色固體狀之標題化合物(14.3 g)。

¹H NMR (CD₃S(O)CD₃) δ 7.48-7.44 (m, 3H), 7.31 (t, 1H), 7.19-7.03 (m, 4H), 6.75 (d, 1H), 5.97 (s, 1H), 3.93 (s, 3H)。

步驟B：1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-4-羥基-2-亞胺基-3-(2-甲氧基苯基)-2H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎊內鹽之製備

在氮下向含有於二甲苯(100 mL)中之6-氯-N-2-吡啶基-3-吡啶甲胺(0.82 g, 3.74 mmol)之溶液中添加 α -氯基-2-甲氧基苯乙酸苯酯(亦即，步驟A之產物)(1.00 g, 3.74 mmol)。將反應混合物加熱至回流，歷時24 h。將混合物冷卻，添加 Celite® 且在減壓下蒸發二甲苯。藉由矽膠層析使用100%乙酸乙酯至1%三乙胺/40%甲醇/59%乙酸乙酯之梯度作為溶離劑純化所得殘餘物以產生呈奶油固體狀之標題化合物(化合物編號662)(4.7 mg)，一種本發明之化合物。MS (AP+) = 393。

$^1\text{H NMR}$ (CD_3COCD_3) δ 8.47 (d, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.83 (t, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.38-7.27 (m, 5H), 6.94-6.88 (m, 2H), 5.71 (s, NH), 5.62 (s, 2 H), 3.64 (s, 3H)。

合成實例11

1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-3-苯基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎊內鹽之製備

步驟A：N-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-苯基-N-(2-吡啶基)丙醯胺酸乙酯之製備

遵循 *Journal of Organic Chemistry* 2000, 65, 5834-5836 中之程序製備2-苯基丙二酸單乙酯。將2-苯基丙二酸單乙酯(1.02 g, 5.0 mmol)溶於無水二氯甲烷(10 mL)中，且添加乙二醯氯(0.52 mL, 6.0 mmol)，接著添加一滴N,N-二甲基甲醯胺。將反應混合物攪拌30 min，接著濃縮，再溶解於

無水二氯甲烷(5 mL)中，且添加至0°C下6-氯-N-2-吡啶基-3-吡啶甲胺(亦即，實例3步驟A之產物)(1.1 g, 5.0 mmol)及三乙胺(0.83 mL, 6.0 mmol)於無水二氯甲烷(5 mL)中之溶液中。使經攪拌之反應混合物經30 min溫至室溫。將反應混合物傾倒至矽膠濾筒(由Varian製造之Bond Elute®)上且使用0-50%乙酸乙酯/己烷之梯度純化。將所需產物與起始胺之混合物分離(1.3 g 33 mol%回收胺/67 mol%所需產物)。將2-苯基丙二酸單乙酯(0.54 g, 2.6 mmol)溶於無水二氯甲烷(3 mL)中，且添加乙二醯氯(0.26 mL, 3.0 mmol)，接著添加一滴*N,N*-二甲基甲醯胺。將反應混合物攪拌，直至氣體停止溢出且接著濃縮，再溶解於無水二氯甲烷(3 mL)中，且添加至先前分離之回收胺與所需產物之混合物中。將反應混合物攪拌30 min且接著濃縮，且如已描述將粗殘餘物層析以產生呈固體狀之標題化合物(0.9 g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 8.50 (m, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.60-7.75 (m, 2H), 7.2-7.3 (m, 5H), 7.13 (m, 2H), 6.87 (s, 1H), 5.13-4.88 (dd, 2H), 4.86 (s, 1H), 4.16 (m, 2H), 1.22 (t, 3H)。

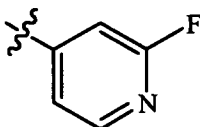
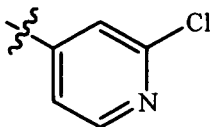
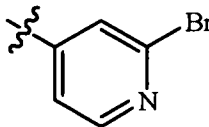
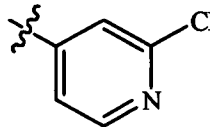
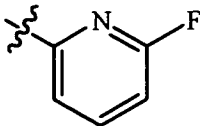
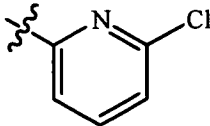
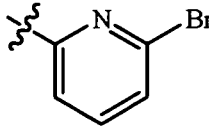
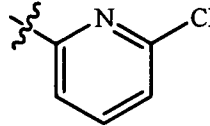
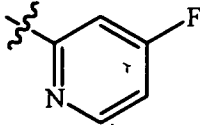
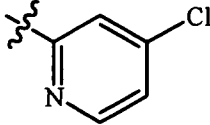
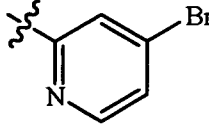
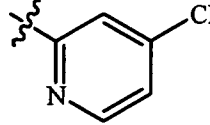
步驟B：1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-羥基-4-側氧基-3-苯基-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶鎘內鹽之製備

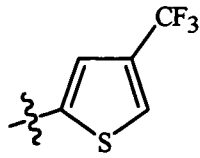
將*N*-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-苯基-*N*-(2-吡啶基)丙醯胺酸乙酯(亦即，步驟A之產物)(200 mg, 0.49 mmol)添加至萘滿(0.5 mL)中，且在200°C下加熱30 min。將反應混合物冷卻且濃縮，且藉由矽膠層析使用50-100%乙酸乙酯/己烷作為溶離劑純化所得殘餘物，以產生呈固體狀之標題化合物

(化合物編號59)(15 mg)，一種本發明之化合物。

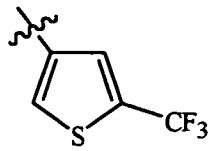
$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 9.55 (dd, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.04 (m, 1H), 7.98 (d, 2H), 7.70 (dd, 1H), 7.2-7.4 (m, 6H), 5.58 (s, 2H)。

藉由本文所述之程序以及此項技術中已知之方法，可製備以下表1至8之化合物。表1至8中所用之縮寫在下文中展示為X-1至X-128及Y-1至Y-71。

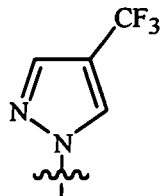
異丙基 X-1	異丁基 X-2	環丙基 X-3	環丁基 X-4	環戊基 X-5
環己基 X-6	CF_3 X-7	CH_2CF_3 X-8	C_2F_5 X-9	$\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{F}$ X-10
1-萘基 X-11	2-萘基 X-12	4-氟-1-萘基 X-13	$\text{C}(\text{O})\text{Me}$ X-14	$\text{C}(\text{O})\text{CF}_3$ X-15
$\text{C}(\text{O})\text{Ph}$ X-16	$\text{C}(\text{O})\text{OMe}$ X-17	$\text{C}(\text{O})\text{OEt}$ X-18	$\text{C}(\text{O})\text{NHMe}$ X-19	$\text{C}(\text{O})\text{NHPh}$ X-20
$\text{C}(\text{S})\text{NHPh}$ X-21	$\text{C}(\text{O})\text{NH}$ (3-甲氧基苯基) X-22	$\text{C}(\text{=NOEt})\text{CF}_3$ X-23		
 X-24	 X-25	 X-26	 X-27	
 X-28	 X-29	 X-30	 X-31	
 X-32	 X-33	 X-34	 X-35	



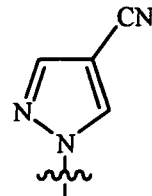
X-36



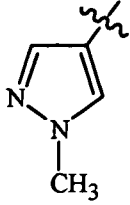
X-37



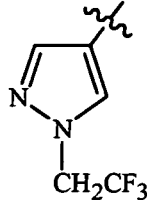
X-38



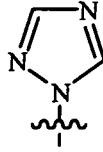
X-39



X-40

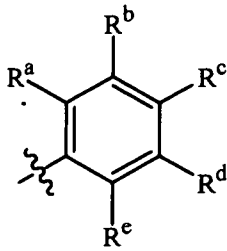


X-41



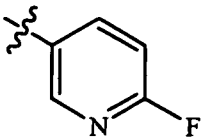
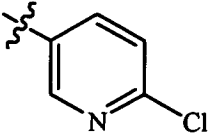
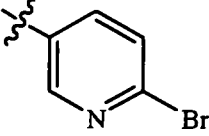
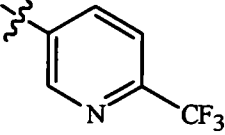
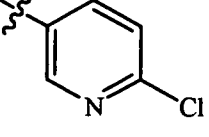
X-42

縮寫 X-50 至 X-128 係關於如下所示之經取代苯環。表中
之空白條目表示氫原子。

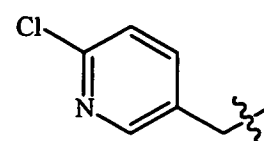
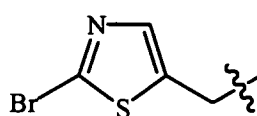
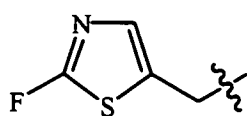
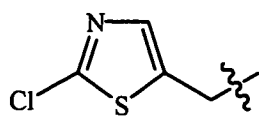


	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e
X-50	F				
X-51	OMe				
X-52	Cl				
X-53		F			
X-54		OMe			
X-55		Cl			
X-56			F		
X-57			OMe		
X-58			Cl		
X-59		CF ₃			
X-60		OCF ₃			
X-61		SCF ₃			
X-62		SF ₅			
X-63		Br			
X-64			氟基		
X-65	F		CF ₃		
X-66	F		OCF ₃		
X-67	F		SCF ₃		
X-68	F		Br		

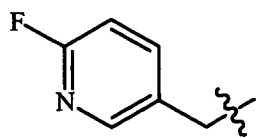
	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e
X-69	S(O)CF ₃				
X-70		S(O)CF ₃			
X-71			S(O)CF ₃		
X-72	Cl		氟基		
X-73	Cl		CF ₃		
X-74	Cl		OCF ₃		
X-75	Cl		SCF ₃		
X-76	Cl		Br		
X-77		Cl		CF ₃	
X-78		Cl		OCF ₃	
X-79		Cl		SCF ₃	
X-80		Cl		Br	
X-81		Br		CF ₃	
X-82		Br		OCF ₃	
X-83		Br		SCF ₃	
X-84		Br		Br	
X-85	F			CF ₃	
X-86	F			OCF ₃	
X-87	F			SCF ₃	
X-88	F			Br	
X-89	F		F		F
X-90	F		F	F	
X-91		F		CF ₃	
X-92		F		OCF ₃	
X-93	F	CF ₃			
X-94	F	OCF ₃			
X-95		F		F	
X-96	OCHF ₂				
X-97		OCHF ₂			
X-98			OCHF ₂		
X-99	SCHF ₂				
X-100		SCHF ₂			
X-101			SCHF ₂		
X-102	F		F		
X-103	F	F			
X-104	F				F
X-105		CF ₃		CF ₃	
X-106	F			OMe	
X-107		OMe		OMe	
X-108	F	OMe			
X-109	F				OMe
X-110		OMe		CF ₃	
X-111		OMe		OCF ₃	
X-112		OMe		Cl	
X-113		OMe		Br	
X-114	OMe			CF ₃	
X-115	OMe			OCF ₃	
X-116	OMe			Cl	
X-117	OMe			Br	
X-118	OMe	F			

	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e
X-119	OMe	OMe			
X-120	OMe			F	
X-121					
X-122					
X-123					
X-124					
X-125				CF ₃	
X-126	OCHF ₂				
X-127		OCHF ₂			
X-128			OCHF ₂		

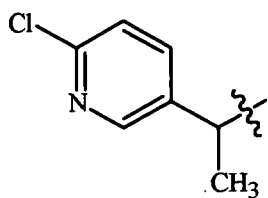
甲基 Y-1	乙基 Y-2	正丙基 Y-3	正丁基 Y-4
CHF ₂ Y-5	CH ₂ CH ₂ CF ₃ Y-6	CH ₂ CH ₂ CF ₂ Cl Y-7	異丙基 Y-8
第二丁基 Y-9	異丁基 Y-10	CH ₂ CH ₂ OCH ₃ Y-11	CH ₂ C(O)OCH ₃ Y-12
CH ₂ CH ₂ SCH ₃ Y-13	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃ Y-14	CH ₂ CH=CH ₂ Y-15	CH ₂ C≡CH Y-16
環丙基 Y-17	環丁基 Y-18	CH ₂ CF ₃ Y-19	CH(CH ₃)CF ₃ Y-20
CH ₂ CF ₂ CF ₃ Y-21	CH ₂ CH ₂ CHF ₂ CF ₂ Cl Y-22		



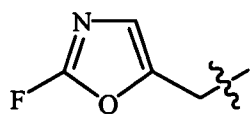
Y-30



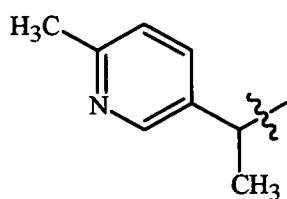
Y-34



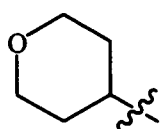
Y-38



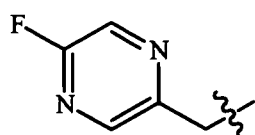
Y-42



Y-46

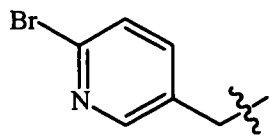


Y-50

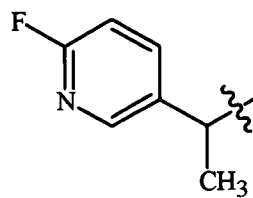


Y-54

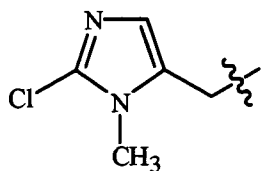
Y-31



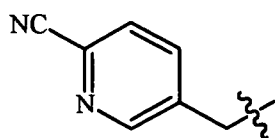
Y-35



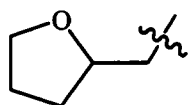
Y-39



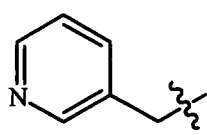
Y-43



Y-47

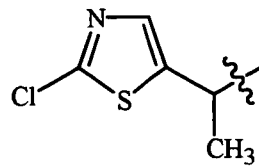


Y-51

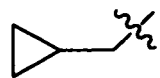


Y-55

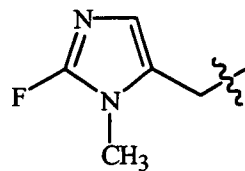
Y-32



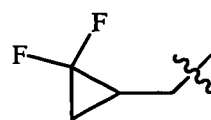
Y-36



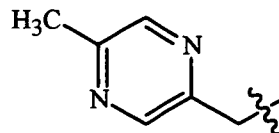
Y-40



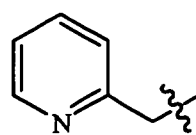
Y-44



Y-48

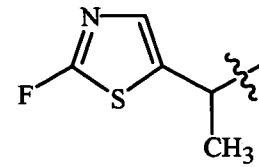


Y-52

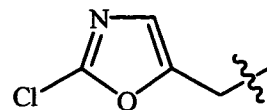


Y-56

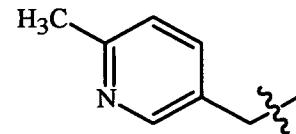
Y-33



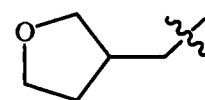
Y-37



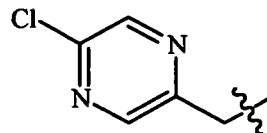
Y-41



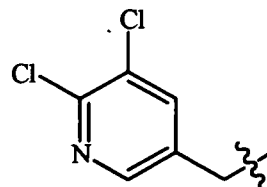
Y-45



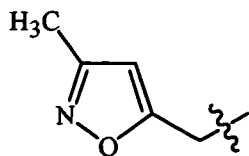
Y-49



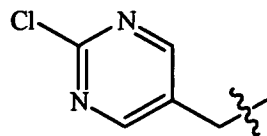
Y-53



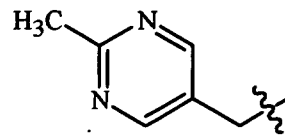
Y-57



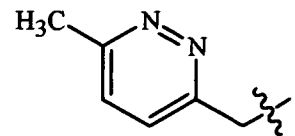
Y-58



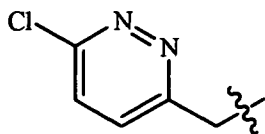
Y-59



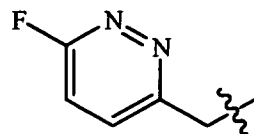
Y-60



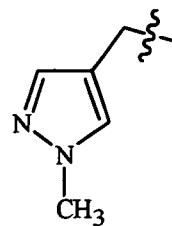
Y-61



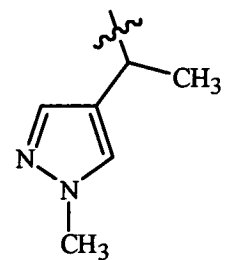
Y-62



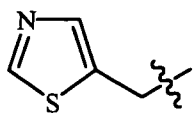
Y-63



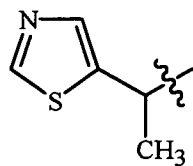
Y-64



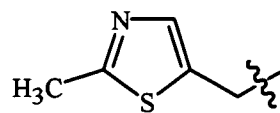
Y-65



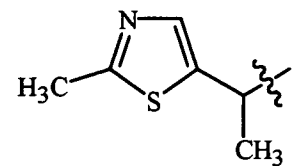
Y-66



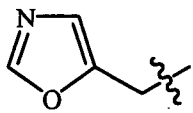
Y-67



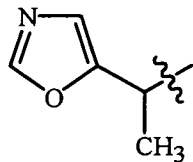
Y-68



Y-69

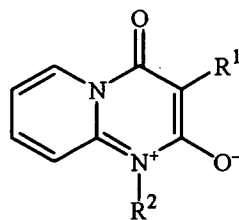


Y-70



Y-71

表 1

R² 為 Y-1

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67

X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-2

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-3

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-4

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20

X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-5

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-6

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-7

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-8

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-9

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97

X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-10

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-11

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-12

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40

X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-13

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-14

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-15

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-16

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-17

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97

X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-18

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-19

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-20

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40



X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-21

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-22

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-30

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-31

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-32

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97

X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-33

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-34

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-35

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40

X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-36

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-37

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-38

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-39

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-40

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97

X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-41

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-42

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-43

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40

X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-44

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-45

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-46

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-47

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-48

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97

X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-49

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-50

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-51

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40

X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-52

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-53

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-54

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-55

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-56

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97

X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-57

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-58

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-59

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40

X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-60

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-61

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-62

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-63

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-64

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97

X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-65

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-66

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-67

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40

X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-68

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R^2 為 Y-69

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-70

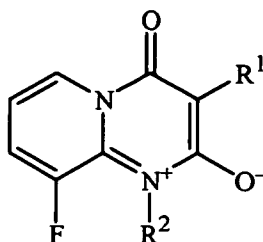
R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

R² 為 Y-71

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-1	X-2	X-3	X-4	X-5	X-6	X-7	X-8	X-9	X-10
X-11	X-12	X-13	X-14	X-15	X-16	X-17	X-18	X-19	X-20
X-21	X-22	X-23	X-24	X-25	X-26	X-27	X-28	X-29	X-30
X-31	X-32	X-33	X-34	X-35	X-36	X-37	X-38	X-39	X-40
X-41	X-42	X-50	X-51	X-52	X-53	X-54	X-55	X-56	X-57
X-58	X-59	X-60	X-61	X-62	X-63	X-64	X-65	X-66	X-67
X-68	X-69	X-70	X-71	X-72	X-73	X-74	X-75	X-76	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-91	X-92	X-93	X-94	X-95	X-96	X-97
X-98	X-99	X-100	X-101	X-102	X-103	X-104	X-105	X-106	X-107
X-108	X-109	X-110	X-111	X-112	X-113	X-114	X-115	X-116	X-117
X-118	X-119	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125	X-126	X-127
X-128									

表 2

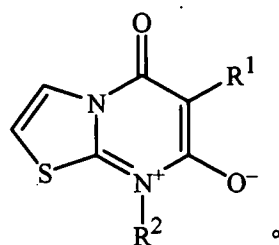
表 2 與表 1 相同建構，其中例外為表 1 標題下之化學結構
經以下結構置換：



舉例而言，表2中之第一化合物為上文剛剛所示之結構，其中如針對表1所定義， R^1 為X-1且 R^2 為Y-1。

表3

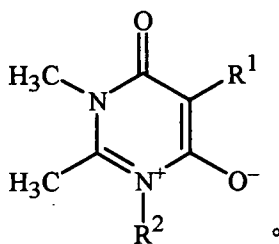
表3與表1相同建構，其中例外為表1標題下之化學結構經以下結構置換：



舉例而言，表3中之第一化合物為上文剛剛所示之結構，其中如針對表1所定義， R^1 為X-1且 R^2 為Y-1。

表4

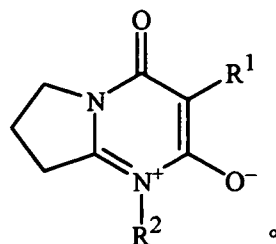
表4與表1相同建構，其中例外為表1標題下之化學結構經以下結構置換：



舉例而言，表4中之第一化合物為上文剛剛所示之結構，其中如針對表1所定義， R^1 為X-1且 R^2 為Y-1。

表5

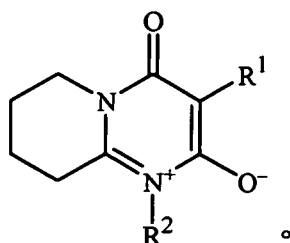
表5與表1相同建構，其中例外為表1標題下之化學結構經以下結構置換：



舉例而言，表5中之第一化合物為上文剛剛所示之結構，其中如針對表1所定義， R^1 為X-1且 R^2 為Y-1。

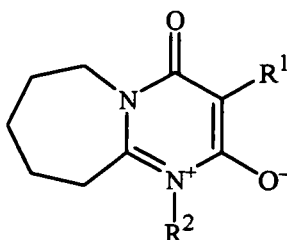
表6

表6與表1相同建構，其中例外為表1標題下之化學結構經以下結構置換：



舉例而言，表6中之第一化合物為上文剛剛所示之結構，其中如針對表1所定義， R^1 為X-1且 R^2 為Y-1。

表7



R^2 為Y-3

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R^2 為Y-19

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R^2 為 Y-20

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

 R^2 為 Y-22

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

 R^2 為 Y-30

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

 R^2 為 Y-31

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

 R^2 為 Y-33

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R² 為 Y-34

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R² 為 Y-36

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R² 為 Y-37

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R² 為 Y-38

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R² 為 Y-39

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R² 為 Y-40

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R² 為 Y-45

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R² 為 Y-49

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R² 為 Y-52

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R² 為 Y-53

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R² 為 Y-55

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R² 為 Y-64

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R² 為 Y-65

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R² 為 Y-66

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R² 為 Y-67

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R^2 為 Y-68

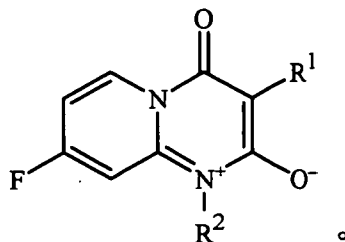
R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

R^2 為 Y-69

R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1	R^1
X-15	X-17	X-25	X-26	X-27	X-31	X-35	X-50	X-51	X-52
X-53	X-54	X-55	X-56	X-57	X-59	X-60	X-61	X-63	X-77
X-78	X-79	X-80	X-81	X-82	X-83	X-84	X-85	X-86	X-87
X-88	X-89	X-90	X-93	X-94	X-97	X-100	X-102	X-103	X-105
X-106	X-107	X-108	X-118	X-120	X-121	X-122	X-123	X-124	X-125

表 8

表 8 與表 7 相同建構，其中例外為表 7 標題下之化學結構經以下結構置換：



舉例而言，表 8 中之第一化合物為上文剛剛所示之結構，其中如針對表 7 所定義， R^1 為 X-15 且 R^2 為 Y-3。

本發明之化合物一般將用作與至少一種用作載劑之選自由界面活性劑、固體稀釋劑及液體稀釋劑組成之群的其他組份之組合物(亦即，調配物)中之無脊椎害蟲控制活性成份。該等調配物或組合物成份經選擇與活性成份之物理性

質、施用模式及諸如土壤類型、濕度及溫度之環境因素相容。

適用調配物包括液體組合物與固體組合物兩者。液體組合物包括視情況可稠化為凝膠之溶液(包括可乳化濃縮物)、懸浮液、乳液(包括微乳液及/或懸浮乳液)及其類似物。水性液體組合物之一般類型為可溶性濃縮物、懸浮濃縮物、膠囊懸浮液、濃縮乳液、微乳液及懸浮乳液。非水性液體組合物之一般類型為可乳化濃縮物、可微乳化濃縮物、可分散濃縮物及油性分散液。

固體組合物之一般類型為水分散性(「可濕性」)或水溶性粉劑、散劑、顆粒、小球、球粒、片劑、錠劑、填充膜(包括種子包衣)及其類似物。由成膜溶液或可流動懸浮液形成之膜及包衣尤其適用於種子處理。活性成份可經(微)囊封且進一步形成為懸浮液或固體調配物；或者活性成份之整個調配物可經囊封(或「經包覆」)。囊封可控制或延遲活性成份之釋放。可乳化顆粒將可乳化濃縮物調配物與乾燥顆粒調配物之益處組合。高濃度組合物主要用作供進一步調配用之中間物。

可噴霧調配物通常在噴霧之前摻入合適介質中。該等液體及固體調配物經調配以易於稀釋在噴霧介質、通常水中。噴霧體積可在每公頃約一公升至數千公升之範圍內，但更通常在每公頃約十公升至數百公升之範圍內。可噴霧調配物可與水或另一合適介質進行桶式混合，以便藉由空中或地面施用而進行葉枝處理，或以便施用至植物之生長

介質。液體及乾燥調配物可直接計量至滴灌系統中或在種植期間計量至犁溝中。液體及固體調配物可在種植之前施用於作物及其他所要植被之種子上作為種子處理，以經由系統性吸收來保護發育中之根部及其他地下植物部分及/或葉枝。

該等調配物通常將含有在以下近似範圍內之有效量的活性成份、稀釋劑及界面活性劑，其合計達100重量%。

	重量%		
	活性成份	稀釋劑	界面活性劑
水分散性及水溶性顆粒、錠劑及散劑	0.001-90	0-99.999	0-15
油性分散液、懸浮液、乳液、溶液(包括可乳化濃縮物)	1-50	40-99	0-50
粉劑	1-25	70-99	0-5
顆粒及小球	0.001-95	5-99.999	0-15
高濃度組合物	90-99	0-10	0-2

固體稀釋劑包括(例如)諸如膨潤土、蒙脫石、鎂鋁海泡石及高嶺土之黏土、石膏、纖維素、二氧化鈦、氧化鋅、澱粉、糊精、糖(例如，乳糖、蔗糖)、二氧化矽、滑石、雲母、矽藻土、尿素、碳酸鈣、碳酸鈉及碳酸氫鈉及硫酸鈉。典型固體稀釋劑描述於Watkins等人，*Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*，第2版，Dorland Books, Caldwell, New Jersey中。

液體稀釋劑包括(例如)水、*N,N*-二甲基烷醯胺(例如，*N,N*-二甲基甲醯胺)、檸檬烯、二甲亞砷、*N*-烷基吡咯啉酮(例如，*N*-甲基吡咯啉酮)、乙二醇、三乙二醇、丙二醇、二丙二醇、聚丙二醇、碳酸丙二酯、碳酸丁二酯、石

蠟(例如，白色礦物油、正構石蠟、異構石蠟)、烷基苯、烷基萘、甘油、三乙酸甘油酯、山梨糖醇、三醋精、芳烴、脫芳構化脂族化合物、烷基苯、烷基萘、酮(諸如，環己酮、2-庚酮、異佛爾酮及4-羥基-4-甲基-2-戊酮)、乙酸酯(諸如，乙酸異戊酯、乙酸己酯、乙酸庚酯、乙酸辛酯、乙酸壬酯、乙酸十三烷酯及乙酸異冰片酯)、其他酯(諸如，烷基化乳酸酯、二元酯及 γ -丁內酯)及醇，該等醇可為直鏈、分支鏈、飽和或不飽和醇，諸如甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、正己醇、2-乙基己醇、正辛醇、癸醇、異癸醇、異十八烷醇、十六烷醇、十二烷醇、十三烷醇、油醇、環己醇、四氫糠醇、二丙酮醇及苜醇。液體稀釋劑亦包括飽和及不飽和脂肪酸(通常 C_6 - C_{22})之甘油酯，諸如植物種子及果實油(例如，橄欖、蓖麻、亞麻子、芝麻、玉米(玉蜀黍)、花生、向日葵、葡萄籽、紅花、棉籽、大豆、油菜籽、椰子及棕櫚仁之油)、動物來源之脂肪(例如，牛脂、豬肉脂、豬油、鱈魚肝油、魚油)及其混合物。液體稀釋劑亦包括烷基化脂肪酸(例如，甲基化、乙基化、丁基化之脂肪酸)，其中脂肪酸可藉由來自植物及動物來源之甘油酯水解而獲得且可藉由蒸餾而純化。典型液體稀釋劑描述於Marsden, *Solvents Guide*, 第2版, Interscience, New York, 1950中。

本發明之固體及液體組合物通常包括一或多種界面活性劑。當添加至液體中時，界面活性劑(亦稱為「表面活性劑」)一般改變、最通常降低液體之表面張力。視界面活

性劑分子中親水性基團及親脂性基團之性質而定，界面活性劑可用作濕潤劑、分散劑、乳化劑或消泡劑。

界面活性劑可分類為非離子型、陰離子型或陽離子型。適用於本發明之組合物之非離子型界面活性劑包括(但不限於)：醇烷氧基化物，諸如基於天然及合成醇(其為分支鏈或直鏈)且自該等醇及氧化乙烯、氧化丙烯、氧化丁烯或其混合物製備之醇烷氧基化物；胺乙氧基化物、烷醇醯胺及乙氧基化烷醇醯胺；烷氧基化三酸甘油酯，諸如乙氧基化大豆油、蓖麻油及油菜籽油；烷基酚烷氧基化物，諸如辛基酚乙氧基化物、壬基酚乙氧基化物、二壬基酚乙氧基化物及十二烷基酚乙氧基化物(自該等酚及氧化乙烯、氧化丙烯、氧化丁烯或其混合物製備)；自氧化乙烯或氧化丙烯製備之嵌段共聚物及末端嵌段係自氧化丙烯製備之反向嵌段共聚物；乙氧基化脂肪酸；乙氧基化脂肪酸酯及油；乙氧基化甲酯；乙氧基化三苯乙炔基酚(包括自氧化乙烯、氧化丙烯、氧化丁烯或其混合物製備之彼等化合物)；脂肪酸酯、甘油酯、基於羊毛脂之衍生物、聚乙氧基酯(諸如，聚乙氧基化脫水山梨糖醇脂肪酸酯、聚乙氧基化山梨糖醇脂肪酸酯及聚乙氧基化甘油脂肪酸酯)；其他脫水山梨糖醇衍生物，諸如脫水山梨糖醇酯；聚合物界面活性劑，諸如無規共聚物、嵌段共聚物、醇酸peg(聚乙二醇)樹脂、接枝或梳形聚合物及星形聚合物；聚乙二醇(peg)；聚乙二醇脂肪酸酯；基於聚矽氧之界面活性劑；及糖衍生物，諸如蔗糖酯、烷基多醣苷及烷基多醣。

適用之陰離子型界面活性劑包括(但不限於)：烷基芳基磺酸及其鹽；羧酸化醇或烷基酚乙氧基化物；磺酸二苯酯衍生物；木質素及木質素衍生物，諸如木質素磺酸鹽；順丁烯二酸或琥珀酸或其酸酐；烯烴磺酸酯；磷酸酯，諸如醇烷氧基化物之磷酸酯、烷基酚烷氧基化物之磷酸酯及苯乙烯基酚乙氧基化物之磷酸酯；基於蛋白質之界面活性劑；肌胺酸衍生物；苯乙烯基酚醚硫酸酯；油及脂肪酸之硫酸酯及磺酸酯；乙氧基化烷基酚之硫酸酯及磺酸酯；醇之硫酸酯；乙氧基化醇之硫酸酯；胺及醃胺之磺酸酯，諸如*N,N*-烷基牛磺酸酯；苯、異丙苯、甲苯、二甲苯及十二烷基苯及十三烷基苯之磺酸酯；縮合萘之磺酸酯；萘及烷基萘之磺酸酯；分餾石油之磺酸酯；磺基琥珀醃胺酸鹽；及磺基琥珀酸鹽及其衍生物，諸如二烷基磺基琥珀酸鹽。

適用之陽離子型界面活性劑包括(但不限於)：醃胺及乙氧基化醃胺；胺，諸如*N*-烷基丙二胺、三丙三胺及二丙四胺及乙氧基化胺、乙氧基化二胺及丙氧基化胺(自該等胺及氧化乙烯、氧化丙烯、氧化丁烯或其混合物製備)；胺鹽，諸如胺乙酸鹽，及二胺鹽；四級銨鹽，諸如四級鹽、乙氧基化四級鹽及雙四級鹽；及氧化胺，諸如氧化烷基二甲胺及氧化雙-(2-羥乙基)-烷基胺。

非離子型界面活性劑與陰離子型界面活性劑之混合物或非離子型界面活性劑與陽離子型界面活性劑之混合物亦適用於本發明之組合物。非離子型、陰離子型及陽離子型界面活性劑及其推薦用途揭示於多種已出版參考文獻中，該

等參考文獻包括 *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 之 McCutcheon 分部出版之年刊美國版及國際版；Sisely 及 Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964；及 A. S. Davidson 及 B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, 第 7 版，John Wiley and Sons, New York, 1987。

本發明之組合物亦可含有調配助劑及添加劑，熟習此項技術者稱為調配輔助劑(其中有一些可視為亦充當固體稀釋劑、液體稀釋劑或界面活性劑)。該等調配助劑及添加劑可控制：pH 值(緩衝劑)、處理期間之發泡(消泡劑，諸如聚有機矽氧烷)、活性成份之沈降(懸浮劑)、黏度(觸變性增稠劑)、容器內微生物生長(抗菌劑)、產物凍結(抗凍劑)、顏色(染料/顏料分散液)、洗掉(成膜劑或黏著劑)、蒸發(防蒸發劑)及其他調配物屬性。成膜劑包括(例如)聚乙酸乙烯酯、聚乙酸乙烯酯共聚物、聚乙烯吡咯啉酮-乙酸乙烯酯共聚物、聚乙烯醇、聚乙烯醇共聚物及蠟。調配助劑及添加劑之實例包括 McCutcheon 之第 2 卷：*Functional Materials*, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 之 McCutcheon 分部出版之年刊國際版及北美版；及 PCT 公開案 WO 03/024222 中列出之彼等助劑及添加劑。

式 1 化合物及任何其他活性成份通常藉由將活性成份溶於溶劑中或藉由在液體或無水稀釋劑中研磨而併入本發明之組合物中。溶液(包括可乳化濃縮物)可藉由簡單地將成

份混合來製備。若意欲用作可乳化濃縮物之液體組合物的溶劑與水不混溶，則通常添加乳化劑以在用水稀釋之後使含活性劑之溶劑乳化。可使用介質研磨機將粒子直徑高達2,000 μm 之活性成份漿液濕式研磨，以獲得平均直徑低於3 μm 之粒子。可將水性漿液製成最終的懸浮濃縮物(參見例如U.S. 3,060,084)或藉由噴霧乾燥進一步處理以形成水分散性顆粒。乾燥調配物通常需要乾式研磨處理，其產生2至10 μm 範圍內之平均粒子直徑。粉劑及散劑可藉由摻合且通常研磨(諸如，用槌式研磨機或流體能研磨機)來製備。顆粒及小球可藉由將活性物質噴霧在預成型粒狀載劑上或藉由聚結技術來製備。參見 Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, 1967年12月4日，第147-48頁，*Perry's Chemical Engineer's Handbook*，第4版，McGraw-Hill, New York, 1963，第8-57頁及以後內容及WO 91/13546。小球可如U.S. 4,172,714中所述來製備。水分散性及水溶性顆粒可如U.S. 4,144,050、U.S. 3,920,442及DE 3,246,493中所教示來製備。錠劑可如U.S. 5,180,587、U.S. 5,232,701及U.S. 5,208,030中所教示來製備。薄膜可如GB 2,095,558及U.S. 3,299,566中所教示來製備。

關於調配技術之其他資訊，參見T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox-Product Forms for Modern Agriculture", *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T. Brooks及T. R. Roberts

編，第九次農藥化學國際會議之會議記錄，The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999，第120-133頁。亦參見U.S. 3,235,361，第6欄第16行至第7欄第19行及實例10-41；U.S. 3,309,192，第5欄第43列至第7欄第62行及實例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138-140、162-164、166、167及169-182；U.S. 2,891,855，第3欄第66行至第5欄第17行及實例1-4；Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961，第81-96頁；Hance等人，*Weed Control Handbook*，第8版，Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989；及*Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000。

在以下實例中，所有調配物均以習知方式製備。化合物編號係指索引表A-F中之化合物。不作進一步詳細說明，咸信熟習此項技術者使用前述描述可最大程度地利用本發明。因此，以下實例應理解為僅具說明性，且決不以任何方式限制本揭示案。除非另外指示，否則百分比係以重量計。

實例A

高濃度濃縮物

化合物7	98.5%
二氧化矽氣凝膠	0.5%
合成非晶形精細二氧化矽	1.0%

實例 B

可濕性散劑

化合物50	65.0%
十二烷基酚聚乙二醇醚	2.0%
木質素磺酸鈉	4.0%
鋁矽酸鈉	6.0%
蒙脫石(煅燒)	23.0%

實例 C

顆粒

化合物138	10.0%
鎂鋁海泡石顆粒(低揮發性物質，0.71/0.30 mm；U.S.S.編號25-50篩)	90.0%

實例 D

擠壓小球

化合物157	25.0%
無水硫酸鈉	10.0%
粗木質素磺酸鈣	5.0%
烷基萘磺酸鈉	1.0%
鈣/鎂膨潤土	59.0%

實例 E

可乳化濃縮物

化合物7	10.0%
聚氧乙烯山梨糖醇六油酸酯	20.0%
C ₆ -C ₁₀ 脂肪酸甲酯	70.0%

實例 F

微乳液

化合物50	5.0%
聚乙烯吡咯啉酮-乙酸乙烯酯共聚物	30.0%
烷基多醣苷	30.0%
單油酸甘油酯	15.0%
水	20.0%

實例 G

種子處理

化合物138	20.00%
聚乙烯吡咯啉酮-乙酸乙烯酯共聚物	5.00%
褐煤酸蠟	5.00%
木質素磺酸鈣	1.00%
聚氧化乙烯/聚氧化丙烯嵌段共聚物	1.00%
硬脂醇(POE 20)	2.00%
聚有機矽烷	0.20%
顏料紅染料	0.05%
水	65.75%

實例 H

肥料棒

化合物157	2.50%
吡咯啉酮-苯乙烯共聚物	4.80%
三苯乙烯苯基16-乙氧基化物	2.30%
滑石	0.80%
玉米澱粉	5.00%
Nitrophoska [®] 持久15-9-15緩釋肥料(BASF)	36.00%
高嶺土	38.00%
水	10.60%

本發明之化合物展示抵抗廣泛譜系之無脊椎害蟲之活性。此等害蟲包括存在於諸如(例如)植物葉枝、根、土壤、已收穫作物或其他糧食、建築結構或動物毛皮之多種環境中之無脊椎動物。此等害蟲包括(例如)以葉枝(包括葉、莖、花及果實)、種子、木材、紡織纖維或動物血液或組織為食，且進而對(例如)生長中或儲存之農作物、森林、溫室作物、觀賞植物、苗圃作物、儲存之糧食或纖維產品，或房屋或其他結構或其內含物造成傷害或損害，或危害動物健康或公眾健康之無脊椎動物。熟習此項技術者應瞭解並非所有化合物皆同等有效地抵抗所有生長階段之所有害蟲。

因此，此等本發明之化合物及組合物在農藝上適用於保護農作物免遭植食性無脊椎害蟲侵襲，且亦在非農藝上保護其他園藝作物及植物免遭植食性無脊椎害蟲侵襲。此效用包括保護含有由基因工程(亦即，轉殖基因)引入或由突變誘發改變之基因物質以提供有利特性之作物及其他植物(亦即，農藝與非農藝兩者)。該等特性之實例包括對除草劑之耐受性、對植食性害蟲(例如，昆蟲、蠕、蚜蟲、蜘蛛、線蟲、蝸牛、植物病原性真菌、細菌及病毒)之抵抗性、改良之植物生長、增強之對諸如高溫或低溫、低土壤濕度或高土壤濕度及高鹽度之不利生長條件的耐受性、增加之開花或結果、更大收穫產量、更迅速成熟、收穫產品之更高品質及/或營養價值，或收穫產品之改良儲存或加工性質。轉殖基因植物可經修飾以表現多種特性。含有由

基因工程或突變誘發提供之特性之植物的實例包括諸如 YIELD GARD[®]、KNOCKOUT[®]、STARLINK[®]、BOLLGARD[®]、NuCOTN[®]及NEWLEAF[®]之表現殺昆蟲性蘇雲金芽孢桿菌(*Bacillus thuringiensis*)毒素之玉米、棉花、大豆及馬鈴薯品種，及諸如 ROUNDUP READY[®]、LIBERTY LINK[®]、IMI[®]、STS[®]及 CLEARFIELD[®]之玉米、棉花、大豆及油菜籽之除草劑耐受品種，以及表現 *N*-乙醯基轉移酶(GAT)以提供對草甘膦除草劑之抵抗性之作物，或含有提供對抑制乙醯乳酸合成酶(ALS)之除草劑之抵抗性的HRA基因之作物。本發明之化合物及組合物可與藉由基因工程引入或藉由突變誘發改變之特性協同相互作用，因而增強該等特性之表型表現或有效性或增大本發明之化合物及組合物之無脊椎害蟲控制有效性。詳言之，本發明之化合物及組合物可與對無脊椎害蟲有毒之蛋白質或其他天然產品之表型表現協同相互作用以提供對此等害蟲之大於累加之控制。

本發明之組合物亦可視情況包含植物養分，例如包含至少一種選自氮、磷、鉀、硫、鈣、鎂、鐵、銅、硼、錳、鋅及鉬之植物養分的肥料組合物。值得注意的為包含至少一種肥料組合物之組合物，該肥料組合物包含至少一種選自氮、磷、鉀、硫、鈣及鎂之植物養分。進一步包含至少一種植物養分之本發明之組合物可呈液體或固體形式。值得注意的為呈顆粒、小棒或錠劑形式之固體調配物。包含肥料組合物之固體調配物可藉由將本發明之化合物或組合

物與肥料組合物以及調配成份混合且接著藉由諸如造粒或擠壓之方法製備調配物來製備。或者，固體調配物可藉由將本發明之化合物或組合物於揮發性溶劑中之溶液或懸浮液噴霧於先前製備之呈尺寸穩定混合物(例如，顆粒、小棒或錠劑)形式之肥料組合物上且接著蒸發溶劑來製備。

農藝及非農藝無脊椎害蟲之實例包括：鱗翅目(Lepidoptera)之卵、幼蟲及成蟲，諸如夜蛾科(Noctuidae)之黏蟲、毛蟲、尺蠖及實夜蛾(heliothine)(例如，粉莖螟(大螟(*Sesamia inferens*)(Walker))、玉米桿蛀蟲(蛀莖夜蛾(*Sesamia nonagrioides*)(Lefebvre))、南部黏蟲(南部灰翅夜蛾(*Spodoptera eridania*)(Cramer))、秋天行軍蟲(草地貪夜蛾(*Spodoptera frugiperda*)(J. E. Smith))、甜菜黏蟲(甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua*)(Hübner))、棉樹葉蟲(灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis*)(Boisduval))、黃條黏蟲(鳥狀夜蛾(*Spodoptera ornithogalli*)(Guenée))、黑毛蟲(小地老虎(*Agrotis ipsilon*)(Hufnagel))、藜豆夜蛾(velvetbean caterpillar)(藜豆夜蛾(*Anticarsia gemmatilis*)(Hübner))、綠色螟蛉(green fruitworm)(綠果夜蛾(*Lithophane antennata*)(Walker))、甘藍黏蟲(甘藍夜蛾(*Barathra brassicae*)(Linnaeus))、大豆尺蠖(大豆夜蛾(*Pseudoplusia includens*)(Walker))、甘藍尺蠖(粉紋夜蛾(*Trichoplusia ni*)(Hübner))、煙草蚜蟲(美洲煙葉蛾(*Heliothis virescens*)(Fabricius)))；螟蛾科(Pyralidae)之蛀蟲、鞘蛾幼蟲、結網蟲、錐蟲、甘藍毛蟲及雕葉蟲(例如，歐洲玉米

蛀蟲(歐洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis*)(Hübner))、臍橙蟲(臍橙螟(*Amyelois transitella*)(Walker))、玉米根結網蟲(玉米根草螟(*Crambus caliginosellus*)(Clemens))、草地結網蟲(螟蛾科：草螟亞科(*Crambinae*))(諸如草地蟲(草地結網毛蟲(*Herpetogramma licarsisalis*)(Walker)))、甘蔗螟蟲(甘蔗二點螟(*Chilo infuscatellus*)(Snellen))、番茄小蛀蟲(優美螟蟲(*Neoleucinodes elegantalis*)(Guenée))、綠色小卷葉蛾(稻縱卷葉螟(*Cnaphalocerus medinalis*))、葡萄小卷葉蛾(葡萄野螟(*Desmia funeralis*)(Hübner))、甜瓜蟲(瓜野螟(*Diaphania nitidalis*)(Stoll))、甘藍內部幼蟲(甘藍蛆(*Helluala hydralis*)(Guenée))、黃色蛀莖蟲(三化螟(*Scirpophaga incertulas*)(Walker))、早芽蛀蟲(黃尾白螟(*Scirpophaga infuscatellus*)(Snellen))、白色蛀莖蟲(稻白螟(*Scirpophaga innotata*)(Walker))、頂芽蛀蟲(黃尾白螟(*Scirpophaga nivella*)(Fabricius))、深色頭稻蛀蟲(臺灣稻螟(*Chilo polychrysus*)(Meyrick))、甘藍煙草夜蛾(大菜螟(*Crociodolomia binotalis*)(English)))；卷蛾科(Tortricidae)之小卷葉蛾、蚜蟲、種子蟲及果實蟲(例如，蘋果卷葉蛾(蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella*)(Linnaeus))、葡萄漿果小卷蛾(葡萄螟蛾(*Endopiza viteana*)(Clemens))、東方果蠹蛾(梨小食心蟲(*Grapholita molesta*)(Busck))、柑橘偽蘋果蠹蛾(蘋果異形小卷蛾(*Cryptophlebia leucotreta*)(Meyrick))、柑橘蛀蟲(柑橘螟蟲(*Ecdytolopha aurantiana*)(Lima))、紅帶小卷葉蛾(紅帶卷蛾(*Argyrotaenia velutinana*)(Walker))、斜帶

小卷葉蛾 (斜紋卷葉蛾 (*Choristoneura rosaceana*)(Harris))、蘋果淺褐卷葉蛾 (淺棕蘋果蛾 (*Epiphyas postvittana*)(Walker))、歐洲葡萄漿果蛾(葡萄螟蛾 (*Eupoecilia ambiguella*)(Hübner))、蘋果頂芽卷葉蛾(褐卷蛾 (*Pandemis pyrusana*)(Kearfott))、雜食性小卷葉蛾(荷蘭石竹小卷蛾 (*Platynota stultana*)(Walsingham))、棒狀果樹卷葉蛾(疆褐卷蛾 (*Pandemis cerasana*)(Hübner))、蘋果褐卷葉蛾 (蘋果褐卷葉蛾 (*Pandemis heparana*)(Denis 及 Schiffermüller)))；及許多其他有經濟價值的鱗翅目(例如，菱紋背蛾 (diamondback moth)(小菜蛾 (*Plutella xylostella*)(Linnaeus))、紅鈴蟲(棉紅鈴蟲 (*Pectinophora gossypiella*)(Saunders))、秋千毛蟲(舞毒蛾 (*Lymantria dispar*)(Linnaeus))、桃小食心蟲(桃小食蛾 (*Carposina niponensis*)(Walsingham))、桃枝蛀蟲(桃枝麥蛾 (*Anarsia lineatella*)(Zeller))、馬鈴薯塊莖蟲(馬鈴薯塊莖蛾 (*Phthorimaea operculella*)(Zeller))、點帶狀潛葉蛾(斑點潛葉蛾 (*Lithocolletis blancardella*)(Fabricius))、亞洲蘋果潛葉蛾(金紋細蛾 (*Lithocolletis ringoniella*)(Matsumura))、稻縱卷葉螟(美洲稻弄蝶 (*Lerodea eufala*)(Edwards))、蘋果潛葉蛾(旋紋潛葉蛾 (*Leucoptera scitella*)(Zeller)))；蜚蠊目 (Blattodea) 之卵、若蟲及成蟲，包括姬蜚蠊科 (Blattellidae) 及蜚蠊科 (Blattidae) 之蟑螂(例如，東方蟑螂 (東方蜚蠊 (*Blatta orientalis*)(Linnaeus))、亞洲蟑螂(亞洲蜚蠊 (*Blatella asahinai*)(Mizukubo))、德國蟑螂(德國小蠊

(*Blattella germanica*)(Linnaeus)、褐帶蟑螂(褐帶蜚蠊(*Supella longipalpa*)(Fabricius))、美洲蟑螂(美洲大蠊(*Periplaneta americana*)(Linnaeus))、褐色蟑螂(褐色蜚蠊(*Periplaneta brunnea*)(Burmeister))、馬德拉蟑螂(馬德拉蜚蠊(*Leucophaea maderae*)(Fabricius))、煙棕蟑螂(煙棕蜚蠊(*Periplaneta fuliginosa*)(Service))、澳洲蟑螂(澳洲蜚蠊(*Periplaneta australasiae*)(Fabr.))、灰色蟑螂(灰色蜚蠊(*Nauphoeta cinerea*)(Olivier))及光滑蟑螂(光滑蜚蠊(*Symploce pallens*)(Stephens)))；鞘翅目(Coleoptera)之卵、食葉、食果實、食根、食種子及食泡沫組織之幼蟲及成蟲，包括長角象甲科(Anthribidae)、豆象科(Bruchidae)及象蟲科(Curculionidae)之象鼻蟲(例如，棉籽象鼻蟲(棉鈴象甲(*Anthonomus grandis*)(Boheman))、稻水象鼻蟲(稻象甲(*Lissorhoptrus oryzophilus*)(Kuschel))、穀倉象鼻蟲(穀象(*Sitophilus granarius*)(Linnaeus))、米象(米象鼻蟲(*Sitophilus oryzae*)(Linnaeus))、一年生莓系牧草象鼻蟲(早熟禾象鼻蟲(*Listronotus maculicollis*)(Dietz))、莓系牧草喙甲(小型穀喙甲(*Sphenophorus parvulus*)(Gyllenhal))、狩獵型喙甲(草皮步行象鼻蟲(*Sphenophorus venatus vestitus*))、丹佛喙甲(丹佛穀喙甲(*Sphenophorus cicatristriatus*)(Fahraeus)))；葉甲科(Chrysomelidae)之跳甲、黃瓜葉甲、根蟲、葉甲、馬鈴薯甲蟲及潛葉蛾(例如，科羅拉多馬鈴薯甲蟲(Colorado potato beetle)(馬鈴薯甲蟲(*Leptinotarsa decemlineata*)(Say))、西方玉米根蟲(玉

米根螢葉甲 (*Diabrotica virgifera virgifera*)(LeConte)))；金龜科 (Scarabaeidae) 之金龜子及其他甲蟲 (例如，日本甲蟲 (日本麗金龜 (*Popillia japonica*)(Newman))、東方甲蟲 (東方麗金龜 (*Anomala orientalis*)(Waterhouse)、東方異麗金龜 (*Exomala orientalis*)(Waterhouse)(Baraud))、北方圓頭犀金龜 (北方花面金龜 (*Cyclocephala borealis*)(Arrow))、南方圓頭犀金龜 (南方花面金龜 (*Cyclocephala immaculata*)(Olivier) 或淺黃金龜 (*C. lurida*)(Bland))、蜣螂及蟻螞 (蜣金龜屬 (*Aphodius* spp.))、黑色草坪草金龜 (黑絨金龜 (*Ataenius spretulus*)(Haldeman))、綠色六月甲蟲 (綠花金龜 (*Cotinis nitida*)(Linnaeus))、亞洲花園甲蟲 (栗色絨金龜 (*Maladera castanea*)(Arrow))、五月/六月甲蟲 (鰓角金龜屬 (*Phyllophaga* spp.)) 及歐洲金龜 (歐洲切根鰓金龜 (*Rhizotrogus majalis*)(Razoumowsky)))；經節蟲科 (Dermestidae) 之地毯甲蟲；叩甲科 (Elateridae) 之線蟲；小蠹科 (Scolytidae) 之小蠹蟲及擬步甲科 (Tenebrionidae) 之粉甲蟲。此外，農藝及非農藝害蟲包括：革翅目 (Dermaptera) 之卵、成蟲及幼蟲，包括：蠹蝮科 (Forficulidae) 之地蜈蚣 (例如，歐洲地蜈蚣 (歐洲蠹蝮 (*Forficula auricularia*)(Linnaeus))、黑地蜈蚣 (黑蠹蝮 (*Chelisoche morio*)(Fabricius)))；半翅目 (Hemiptera) 及同翅目 (Homoptera) 之卵、未成熟蟲、成蟲及若蟲，諸如盲蝽科 (Miridae) 之盲蝽、蟬科 (Cicadidae) 之蟬、葉蟬科 (Cicadellidae) 之葉蟬 (例如，微葉蟬屬 (*Empoasca* spp.))、

臭蟲科 (Cimicidae) 之床蟲 (例如，溫帶臭蟲 (*Cimex lectularius*)(Linnaeus))、蠟蟬科 (Fulgoroidea) 及飛虱科 (Delphacidae) 之蠟蟬、角蟬科 (Membracidae) 之角蟬、木虱科 (Psyllidae) 之木虱、粉虱科 (Aleyrodidae) 之白粉虱、蚜科 (Aphididae) 之蚜蟲、根瘤蚜科 (Phylloxera) 之根瘤蚜蟲、粉蚧科 (Pseudococcidae) 之粉蚧、蚧科 (Coccidae)、盾蚧科 (Diaspididae) 及珠蚧科 (Margarodidae) 之介殼蟲、網蝽科 (Tingidae) 之網蝽、蝽科 (Pentatomidae) 之蝽、長蝽科 (Lygaeidae) 之長蝽 (例如，多毛蝽 (多毛長蝽 (*Blissus leucopterus hirtus*)(Montandon)) 及南方蝽 (南方長蝽 (*Blissus insularis*)(Barber))) 及其他種子蝽、沫蟬科 (Cercopidae) 之沫蟬、緣蝽科 (Coreidae) 之緣蝽及紅蝽科 (Pyrrhocoridae) 之紅蝽及汗棉蟲。亦包括：蟎目 (Acari)(蟎) 之卵、幼蟲、若蟲及成蟲，諸如葉蟎科 (Tetranychidae) 之蛛蟎及紅蟎 (例如，歐洲紅蟎 (蘋果全爪蟎 (*Panonychus ulmi*)(Koch))、二點葉蟎 (two spotted spider mite)(棉葉蟎 (*Tetranychus urticae*)(Koch))、邁氏葉蟎 (McDaniel mite)(邁氏葉蟎 (*Tetranychus mcdanieli*)(McGregor)))；細鬚蟎科 (Tenuipalpidae) 之短鬚蟎 (例如，桔短鬚蟎 (citrus flat mite)(劉氏短鬚蟎 (*Brevipalpus lewisi*)(McGregor)))；瘿蟎科 (Eriophyidae) 之鏽蟎及芽蟎及其他食葉蟎及對於人類及動物健康而言重要之蟎，亦即表皮蟎科 (Epidermoptidae) 之塵蟎、蠕形蟎科 (Demodicidae) 之蠕形蟎、食甜蟎科 (Glycyphagidae) 之穀

蟎；硬蜱科(Ixodidae)之蜱，通常稱為硬蜱(例如，鹿蜱(黑腳硬蜱(*Ixodes scapularis*)(Say))、澳大利亞致癱瘓蜱(Australian paralysis tick)(全環硬蜱(*Ixodes holocyclus*)(Neumann))、美洲狗蜱(American dog tick)(變異革蜱(*Dermacentor variabilis*)(Say))、孤星壁虱(lone star tick)(美洲花蜱(*Amblyomma americanum*)(Linnaeus)))及軟蜱科(Argasidae)之蜱，通常稱為軟蜱(例如，回歸熱蜱(relapsing fever tick)(特氏鈍緣蜱(*Ornithodoros turicata*))、常見雞蜱(common fowl tick)(放射狀銳緣蜱(*Argas radiatus*)))；癢蟎科(Psoroptidae)、蒲蟎科(Pyemotidae)及疥蟎科(Sarcoptidae)之疥蟎；直翅目(Orthoptera)之卵、成蟲及未成熟蟲，包括蚱蜢、蝗蟲及蟋蟀(例如，遷徙蚱蜢(migratory grasshopper)(例如，草地血黑蝗(*Melanoplus sanguinipes*)(Fabricius)、殊種蝗(*M. differentialis*)(Thomas))、美洲蚱蜢(American grasshopper)(例如，南美沙漠蝗(*Schistocerca americana*)(Drury))、沙漠飛蝗(desert locust)(沙漠蝗(*Schistocerca gregaria*)(Forsk.)、飛蝗(migratory locust)(飛蝗(*Locusta migratoria*)(Linnaeus))、灌木蝗蟲(bush locust)(腺蝗屬(*Zonocerus* spp.))、家蟋蟀(house cricket)(家蟋蟀(*Acheta domesticus*)(Linnaeus))、螻蛄(mole cricket)(例如，褐色螻蛄(tawny mole cricket)(褐色螻蛄(*Scapteriscus vicinus*)(Scudder))及南方螻蛄(southern mole cricket)(南方螻蛄(*Scapteriscus borellii*)(Giglio-Tos)))；雙

翅目(Diptera)之卵、成蟲及未成熟蟲，包括潛葉蛾(例如斑潛蠅屬(*Liriomyza* spp.)，諸如蛇狀菜潛葉蠅(serpentine vegetable leafminer)(美洲斑潛蠅(*Liriomyza sativae*)(Blanchard)))、蠓、果蠅(實蠅科(Tephritidae))、黃潛蠅(例如，瑞典稈蠅(*Oscinella frit*)(Linnaeus))、土壤蛆、家蠅(例如，舍蠅(*Musca domestica*)(Linnaeus))、小型家蠅(lesser house fly)(例如，黃腹廢蠅(*Fannia canicularis*)(Linnaeus)、股間廢蠅(*F. femoralis*)(Stein))、廢蠅(例如，廢螯蠅(*Stomoxys calcitrans*)(Linnaeus))、面蠅、角蠅、黑蠅(例如，金蠅屬(*Chrysomya* spp.)、伏蠅屬(*Phormia* spp.))及其他蘚狀蠅害蟲、馬蠅(例如，虻屬(*Tabanus* spp.))、胃蠅(bot fly)(例如，胃蠅屬(*Gastrophilus* spp.))、狂蠅屬(*Oestrus* spp.))、牛皮蠅(cattle grub)(例如，皮蠅屬(*Hypoderma* spp.))、鹿蠅(例如，斑虻屬(*Chrysops* spp.))、羊蟬蠅(例如，綿羊虱蠅(*Melophagus ovinus*)(Linnaeus))及其他短角亞目(Brachycera)、蚊子(例如，伊蚊屬(*Aedes* spp.)、瘧蚊屬(*Anopheles* spp.)、庫蚊屬(*Culex* spp.))、墨蚊(例如，原蚋屬(*Prosimulium* spp.)、蚋屬(*Simulium* spp.))、蠓、砂蠅、尖眼葦蚊及其他長角亞目(Nematocera)；纓翅目(Thysanoptera)之卵、成蟲及未成熟蟲，包括洋蔥薊馬(onion thrip)(煙薊馬(*Thrips tabaci*)(Lindeman))、花薊馬(flower thrip)(花薊馬屬(*Frankliniella* spp.))及其他食葉薊馬；膜翅目(Hymenoptera)之昆蟲害蟲，包括蟻科(Formicidae)之螞

蟻，包括佛羅里達木蟻(*Florida carpenter ant*)(佛羅里達木蟻 (*Camponotus floridanus*)(Buckley))、紅色木蟻 (red carpenter ant)(紅弓背蟻 (*Camponotus ferrugineus*)(Fabricius))、黑色木蟻(賓州黑木工蟻 (*Camponotus pennsylvanicus*)(De Geer))、白足蟻 (white-footed ant)(白足狡臭蟻 (*Technomyrmex albipes*)(fr. Smith))、大頭蟻(大頭蟻屬 (*Pheidole* sp.))、蜜蟻 (ghost ant)(黑頭慌蟻 (*Tapinoma melanocephalum*)(Fabricius))；法老蟻 (Pharaoh ant)(廚蟻 (*Monomorium pharaonis*)(Linnaeus))、小火蟻(小火紅蟻 (*Wasmannia auropunctata*)(Roger))、火蟻(熱帶火蟻 (*Solenopsis geminata*)(Fabricius))、入侵紅火蟻(入侵紅火蟻 (*Solenopsis invicta*)(Buren))、阿根廷蟻 (Argentine ant)(紅蟻 (*Iridomyrmex humilis*)(Mayr))、狂蟻(長角黃山蟻 (*Paratrechina longicornis*)(Latreille))、鋪道蟻(路舍蟻 (*Tetramorium caespitum*)(Linnaeus))、玉米田蟻(異色草蟻 (*Lasius alienus*)(Förster))及臭家蟻(酸臭蟻 (*Tapinoma sessile*)(Say))。其他膜翅目包括蜜蜂(包括木蜂)、大黃蜂、小黃蜂、胡蜂及鋸蜂(新松葉蜂屬 (*Neodiprion* spp.))；灰翅麥莖蜂屬 (*Cephus* spp.)；等翅目 (Isoptera)之昆蟲害蟲，包括白蟻科 (Termitidae)之白蟻(例如，大白蟻屬 (*Macrotermes* sp.)、胖土白蟻 (*Odontotermes obesus*)(Rambur))、木白蟻科 (Kalotermitidae)之白蟻(例如，砂白蟻屬 (*Cryptotermes* sp.))及鼻白蟻科

(Rhinotermitidae)(例如，散白蟻屬 (*Reticulitermes* sp.)、家白蟻屬 (*Coptotermes* sp.)、大別山散白蟻 (*Heterotermes tenuis*)(Hagen))、東方地下散白蟻 (eastern subterranean termite)(黃胸散白蟻 (*Reticulitermes flavipes*)(Kollar))、西方地下散白蟻 (western subterranean termite)(西美散白蟻 (*Reticulitermes hesperus*)(Banks))、臺灣地下散白蟻 (Formosan subterranean termite)(臺灣乳白蟻 (*Coptotermes formosanus*)(Shiraki))、西印度乾木白蟻 (West Indian drywood termite)(移入楹白蟻 (*Incisitermes immigrans*)(Snyder))、粉蠹白蟻 (powder post termite)(麻頭砂白蟻 (*Cryptotermes brevis*)(Walker))、乾木白蟻 (斯氏楹白蟻 (*Incisitermes snyderi*)(Light))、南方地下散白蟻 (southeastern subterranean termite)(弗吉尼亞散白蟻 (*Reticulitermes virginicus*)(Banks))、西方乾木白蟻 (western drywood termite)(小楹白蟻 (*Incisitermes minor*)(Hagen))、樹棲白蟻(諸如，象白蟻屬 (*Nasutitermes* sp.))及具有經濟價值之其他白蟻；纓尾目 (Thysanura)之昆蟲害蟲，諸如蠹蟲(衣魚 (*Lepisma saccharina*)(Linnaeus))及小灶衣魚(家衣魚 (*Thermobia domestica*)(Packard))；食毛目 (Mallophaga)之昆蟲害蟲，且包括頭蝨(人頭蝨 (*Pediculus humanus capitis*)(De Geer))、體虱(人體虱 (*Pediculus humanus*)(Linnaeus))、雞體虱(大雞虱 (*Menacanthus stramineus*)(Nitsch))、狗鬻毛虱(犬鬻毛虱 (*Trichodectes canis*)(De Geer))、雞姬虱(雞圓羽虱

(*Goniocotes gallinae*)(De Geer))、綿羊體虱(綿羊虱(*Bovicola ovis*)(Schrank))、短鼻牛虱(牛血虱(*Haematopinus eurysternus*)(Nitzsch))、長鼻牛虱(牛顎虱(*Linognathus vituli*)(Linnaeus))及其他侵襲人類及動物之吸吮性及咀嚼性寄生虱；蚤目(Siphonoptera)之昆蟲害蟲，包括東方鼠蚤(印度鼠蚤(*Xenopsylla cheopis*)(Rothschild))、貓蚤(貓櫛頭蚤(*Ctenocephalides felis*)(Bouche))、狗蚤(狗櫛頭蚤(*Ctenocephalides canis*)(Curtis))、雞蚤(離角葉蚤(*Ceratophyllus gallinae*)(Schrank))、黏貼蚤(吸著蚤(*Echidnophaga gallinacea*)(Westwood))、人蚤(致癢蚤(*Pulex irritans*)(Linnaeus))及侵襲哺乳動物及鳥類之其他跳蚤。涵蓋之其他節肢動物害蟲包括：蜘蛛目(Araneae)之蜘蛛，諸如褐絲蛛(褐皮花蛛(*Loxosceles reclusa*)(Gertsch及Mulaik))及黑寡婦蜘蛛(黑寡婦球腹蛛(*Latrodectus mactans*)(Fabricius))；及蠍目(Scutigeroforma)之蜈蚣，諸如家蜈蚣(蠍(*Scutigera coleoptrata*)(Linnaeus))。本發明之化合物亦具有對抗線蟲綱、條蟲綱、吸蟲綱及棘頭綱之成員的活性，該等成員包括圓線蟲目(Strongylida)、蛔目(Ascaridida)、蟯蟲目(Oxyurida)、小桿目(Rhabditida)、旋尾目(Spirurida)及嘴刺目(Enoplida)之有經濟價值之成員，諸如(但不限於)有經濟價值之農業害蟲(亦即，根結線蟲(*Meloidogyne*)屬之根結線蟲(root knot nematode)、根腐線蟲(*Pratylenchus*)屬之根腐線蟲(lesion nematode)、毛刺線蟲(*Trichodorus*)屬之殘根線蟲

(stubby root nematode)等)及動物及人類健康之害蟲(亦即,所有具有經濟價值之吸蟲、條蟲及蛔蟲,諸如馬之普通圓線蟲(*Strongylus vulgaris*)、狗之犬弓蛔蟲(*Toxocara canis*)、綿羊之撚轉血矛線蟲(*Haemonchus contortus*)、狗之犬心絲蟲(*Dirofilaria immitis*)(Leidy)、馬之葉狀裸頭條蟲(*Anoplocephala perfoliata*)、反芻動物之肝片吸蟲(*Fasciola hepatica*)Linnaeus等)。

本發明之化合物展示對抗以下各目之害蟲的尤其高之活性：鱗翅目(例如,棉葉蟲(*Alabama argillacea*)(Hübner)(棉葉蟲)、果樹黃卷蛾(*Archips argyrospila*)(Walker)(果樹卷葉蛾)、玫瑰卷葉蛾(*A. rosana*)(Linnaeus)(歐洲卷葉蛾)及其他卷蛾屬物種、二化螟(*Chilo suppressalis*)(Walker)(水稻蛀莖螟)、稻縱卷葉螟(*Cnaphalocrosis medinalis*)(Guenée)(稻卷葉螟)、玉米根草螟(*Crambus caliginosellus*)(Clemens)(玉米根結網毛蟲)、莓系牧草結網毛蟲(*Crambus teterrellus*)(Zincken)(莓系牧草結網毛蟲)、蘋果蠹蛾(幼果蛾)、埃及金剛鑽(*Earias insulana*)(Boisduval)(刺棉鈴蟲)、翠紋金剛鑽(*Earias vittella*)(Fabricius)(斑紋螟蛉)、美洲棉鈴蟲(*Helicoverpa armigera*)(Hübner)(美洲螟蛉)、穀實夜蛾(*Helicoverpa zea*)(Boddie)(玉米穗蟲)、煙芽葉蛾(*Heliothis virescens*)(Fabricius)(煙草芽蟲)、稻切葉野螟(*Herpetogramma licarsisalis*)(Walker)(草地結網毛蟲)、葡萄小卷葉蛾(*Lobesia botrana*)(Denis及Schiffermüller)(葡萄

漿果小卷蛾)、棉紅鈴蟲 (*Pectinophora gossypiella*)(Saunders)(紅鈴蟲)、橘細潛蛾 (*Phyllocnistis citrella*)(Stainton)(柑橘潛葉蛾)、大菜粉蝶 (*Pieris brassicae*)(Linnaeus)(大紋白蝶)、小菜粉蝶 (*Pieris rapae*)(Linnaeus)(小紋白蝶)、小菜蛾(菱紋背蛾)、甜菜夜蛾(甜菜黏蟲)、斜紋夜蛾 (*Spodoptera litura*)(Fabricius)(煙草夜蛾、二點偽鈎翅蛾)、草地貪夜蛾(秋天行軍蟲)、粉紋夜蛾(Hübner)(甘藍銀紋夜蛾)及西紅柿斑潛蠅 (*Tuta absoluta*)(Meyrick)(西紅柿潛葉蛾))。

本發明之化合物亦具有對抗同翅目成員之顯著活性，該等成員包括：豌豆蚜 (*Acyrtosiphon pisum*)(Harris)(豌豆蚜 (pea aphid))、豇豆蚜 (*Aphis craccivora*)(Koch)(豇豆蚜 (cowpea aphid))、蠶豆蚜 (*Aphis fabae*)(Scopoli)(黑豆蚜)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)(Glover)(棉蚜 (cotton aphid)、瓜蚜)、蘋果蚜 (*Aphis pomi*)(De Geer)(蘋果蚜)、鏽線菊蚜 (*Aphis spiraecola*)(Patch)(鏽線菊蚜 (spirea aphid))、馬鈴薯長鬚蚜 (*Aulacorthum solani*)(Kaltenbach)(毛地黃蚜)、草莓釘蚜 (*Chaetosiphon fragaefolii*)(Cockerell)(草莓蚜)、麥雙尾蚜 (*Diuraphis noxia*)(Kurdjumov/Mordvilko)(俄羅斯麥蚜)、玫瑰蘋果蚜 (*Dysaphis plantaginea*)(Paaserini)(玫瑰蘋果蚜 (rosy apple aphid))、蘋果綿蚜 (*Eriosoma lanigerum*)(Hausmann)(蘋果綿蚜)、桃粉蚜 (*Hyalopterus pruni*)(Geoffroy)(桃大尾蚜)、蘿蔔蚜 (*Lipaphis erysimi*)(Kaltenbach)(蘿蔔蚜)、麥無網長管蚜

(Metopolophium dirrhodum)(Walker)(麥蚜)、大戟長管蚜
(Macrosiphum euphorbiae)(Thomas)(馬鈴薯蚜)、桃蚜
(Myzus persicae)(Sulzer)(桃-馬鈴薯蚜、綠桃蚜)、萵苣蚜
 蟲(*Nasonovia ribisnigri*)(Mosley)(萵苣蚜)、癭綿蚜屬
(Pemphigus spp.)(根蚜及癭蚜)、玉米蚜(*Rhopalosiphum*
maidis)(Fitch)(玉米葉蚜)、禾穀縊管蚜(*Rhopalosiphum*
padi)(Linnaeus)(烏櫻桃-燕麥蚜)、麥二叉蚜(*Schizaphis*
graminum)(Rondani)(麥二叉蚜)、麥長管蚜(*Sitobion*
avenae)(Fabricius)(英國穀類蚜蟲)、苜蓿彩斑蚜
(Therioaphis maculata)(Buckton)(斑點紫花苜蓿蚜)、桔二
 叉蚜(*Toxoptera aurantii*)(Boyer de Fonscolombe)(黑色柑橘
 蚜)及褐色橘蚜(*Toxoptera citricida*)(Kirkaldy)(褐色橘蚜)；
 球蚜屬(*Adelges spp.*)(球蚜)；長山核桃根瘤蚜(*Phylloxera*
devastatrix)(Pergande)(美洲山核桃根瘤蚜)；煙草粉虱
(Bemisia tabaci)(Gennadius)(煙粉虱、甘薯粉虱)、銀葉粉
 虱(*Bemisia argentifolii*)(Bellows及Perring)(銀葉粉虱)、柑
 橘粉虱(*Dialeurodes citri*)(Ashmead)(桔粉虱)及溫室粉虱
(Trialeurodes vaporariorum)(Westwood)(溫室粉虱)；馬鈴
 薯小綠葉蟬(*Empoasca fabae*)(Harris)(馬鈴薯葉蟬)、灰飛
 虱(*Laodelphax striatellus*)(Fallen)(小褐飛虱)、四帶葉蟬
(Macrolestes quadrilineatus)(Forbes)(紫莞葉蟬)、綠葉蟬
(Nephotettix cincticeps)(Uhler)(青葉蟬)、黑尾葉蟬
(Nephotettix nigropictus)(Stål)(稻葉蟬)、褐稻虱
(Nilaparvata lugens)(Stål)(褐飛虱)、玉米花翅飛虱

(*Peregrinus maidis*)(Ashmead)(玉米飛虱)、白背飛虱(*Sogatella furcifera*)(Horvath)(白背飛虱 (white-backed planthopper))、美洲稻飛蝨(*Sogatodes orizicola*)(Muir)(稻飛蝨)、蘋果白葉蟬(*Typhlocyba pomaria*)(McAtee)(蘋果白葉蟬)、葡萄葉蟬屬(*Erythroneoura* spp.)(葡萄葉蟬)；十七年蟬(*Magicidada septendecim*)(Linnaeus)(週期蟬)；吹綿蚧殼蟲(*Icerya purchasi*)(Maskell)(綿團蚧殼蟲)、梨圓盾蚧(*Quadraspidiotus perniciosus*)(Comstock)(聖約瑟蟲 (San Jose scale))；柑橘粉蚧(*Planococcus citri*)(Risso)(桔粉蚧)；粉蚧屬(*Pseudococcus* spp.)(其他粉蚧複合物)；梨木虱(*Cacopsylla pyricola*)(Foerster)(梨木虱)、柿木虱(*Trioza diospyri*)(Ashmead)(柿木虱 (persimmon psylla))。

本發明之化合物亦可具有對抗半翅目成員之活性，該等成員包括：綠蝽(*Acrosternum hilare*)(Say)(綠蝽)、南瓜緣蝽(*Anasa tristis*)(De Geer)(南瓜蟲)、多毛長蝽(*Blissus leucopterus*)(Say)(長蝽)、溫帶臭蟲(床虱)、棉網蝽(*Corythuca gossypii*)(Fabricius)(棉網蝽 (cotton lace bug))、番茄蝽(*Cyrtopeltis modesta*)(Distant)(番茄臭蟲)、棉蝽象(*Dysdercus suturellus*)(Herrich-Schäffer)(汗棉蟲)、褐臭蝽(*Euchistus servus*)(Say)(褐臭蝽)、一斑蝽象(*Euchistus variolarius*)(Palisot de Beauvois)(一斑蝽象 (one-spotted stink bug))、*Graptosthetus*屬(種蝽複合物)、松樹緣蝽(*Leptoglossus corculus*)(Say)(松籽緣蝽)、牧草盲蝽(*Lygus lineolaris*)(Palisot de Beauvois)(植食性盲蝽)、稻綠蝽

(*Nezara viridula*)(Linnaeus)(南方綠蝽)、稻蝽(*Oebalus pugnax*)(Fabricius)(稻蝽象(rice stink bug))、美洲脊胸長椿(*Oncopeltus fasciatus*)(Dallas)(大型乳草屬植物蝽)、棉盲蝽(*Pseudatomoscelis seriatus*)(Reuter)(棉盲蝽)。經本發明之化合物控制之其他昆蟲目包括繸翅目(例如,西方花薊馬(*Frankliniella occidentalis*)(Pergande)(西方花薊馬)、柑橘薊馬(*Scirtothrips citri*)(Moulton)(柑桔薊馬)、黃豆薊馬(*Sericothrips variabilis*)(Beach)(大豆薊馬)及煙薊馬(*Thrips tabaci*)(Lindeman)(洋蔥薊馬);及鞘翅目(例如,馬鈴薯甲蟲(科羅拉多馬鈴薯甲蟲)、墨西哥豆瓢(*Epilachna varivestis*)(Mulsant)(墨西哥豆甲蟲)及叩甲屬(*Agriotes*)、山叩甲屬(*Athous*)或金針蟲屬(*Limonius*)之線蟲。

注意當代一些分類系統將同翅目歸為半翅目下之亞目。

值得注意的為本發明之化合物用於控制馬鈴薯葉蟬(馬鈴薯小綠葉蟬)之用途。值得注意的為本發明之化合物用於控制玉米飛虱(玉米花翅飛虱)之用途。值得注意的為本發明之化合物用於控制棉瓜蚜(棉蚜)之用途。值得注意的為本發明之化合物用於控制綠桃蚜(桃蚜)之用途。值得注意的為本發明之化合物用於控制菱紋背蛾(小菜蛾)之用途。值得注意的為本發明之化合物用於控制秋天行軍蟲(草地貪夜蛾)之用途。

值得注意的為本發明之化合物用於控制南方綠蝽象(稻綠蝽)、西方盲蝽(豆莢盲蝽(*Lygus hesperus*))、稻水象甲(稻象甲)、稻褐飛虱(褐稻虱)、黑尾葉蟬(二點黑尾葉蟬

(*Nephotettix virescens*))及水稻二化螟(水稻螟蟲)之用途。

本發明之化合物亦可與一或多種其他生物學活性化合物或藥劑(包括殺昆蟲劑、殺真菌劑、殺線蟲劑、殺菌劑、殺蟎劑、除草劑、除草劑安全劑、生長調節劑(諸如，昆蟲蛻皮抑制劑及生根刺激劑、化學不育劑、化學信息素、驅避劑、引誘劑、信息素、攝食刺激劑)、其他生物學活性化合物或昆蟲病原細菌、病毒或真菌)混合以形成具有甚至更寬農藝及非農藝效用譜之多組份農藥。因此，本發明亦係關於一種組合物，其包含生物學有效量之式1化合物、至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑及液體稀釋劑組成之群之其他組份及至少一種其他生物學活性化合物或藥劑。對於本發明之混合物而言，其他生物學活性化合物或藥劑可與本發明之化合物(包括式1化合物)一起調配，以形成預混合物，或其他生物學活性化合物或藥劑可與本發明之化合物(包括式1化合物)分別調配，且在施用之前將該兩種調配物組合在一起(例如，於噴霧箱中)，或(替代地)依次施用。

該等可與本發明之化合物調配之生物學活性化合物或藥劑之實例為諸如以下各物之殺昆蟲劑：阿巴汀(abamectin)、歐殺松(acephate)、亞醜蟎(acequinocyl)、啞蟲脒(acetamiprid)、阿納寧(acrinathrin)、醯胺氟美(amidoflumet)、三亞蟎(amitraz)、阿維菌素(avermectin)、印楝素(azadirachtin)、穀硫磷(azinphos-methyl)、畢芬寧(bifenthrin)、聯苯腈酯(bifenazate)、雙三氟蟲脲

(bistrifluron)、硼酸鹽、3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氨基-2-甲基-6-[(甲基氨基)羰基]苯基]-1H-吡唑-5-甲醯胺、布芬淨(buprofezin)、硫線磷(cadusafos)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、殺螟丹(cartap)、伐蟲脒(carzol)、氯蟲醯胺(chlorantraniliprole)、蟲蟎腈(chlorfenapyr)、克福隆(chlorfluazuron)、毒死蜱(chlorpyrifos)、甲基毒死蜱(chlorpyrifos-methyl)、環蟲醯肼(chromafenozide)、殺蟎錫(clofentezin)、可尼丁(clothianidin)、噻氟美芬(cyflumetofen)、賽扶寧(cyfluthrin)、 β -賽扶寧、賽洛寧(cyhalothrin)、 γ -賽洛寧、 λ -賽洛寧、賽滅寧(cypermethrin)、 α -賽滅寧、 ζ -賽滅寧、賽滅淨(cyromazine)、溴氟菊酯(deltamethrin)、汰芬隆(diافenthion)、大利松(diazinon)、狄氏劑(dieldrin)、二福隆(diflubenzuron)、四氟甲醚菊酯(dimefluthrin)、殺蟲雙(dimehypo)、大滅松(dimethoate)、呋蟲胺(dinotefuran)、戴芬蘭(diofenolan)、因滅汀(emamectin)、硫丹(endosulfan)、益化利(esfenvalerate)、乙蟲清(ethiprole)、依芬寧(etofenprox)、乙蟎唑(etoxazole)、苯丁錫(fenbutatin oxide)、芬硫克(fenothiocarb)、芬諾克(fenoxycarb)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、氟蟲腈(fipronil)、氟尼胺(flonicamid)、氟苯地胺(flubendiamide)、護賽寧(flucythrinate)、氟芬林(flufenerim)、氟芬隆(flufenoxuron)、氟胺氟戊菊酯(fluvalinate)、氟胺氟菊酯(tau-fluvalinate)、大福松

(fonophos)、複滅蟎(formetanate)、福賽絕(fosthiazate)、
氯蟲醯肼(halofenozide)、六伏隆(hexaflumuron)、噻蟎酮
(hexythiazox)、伏蟻脞(hydramethylnon)、益達胺
(imidacloprid)、節蟲威(indoxacarb)、殺昆蟲皂、亞芬松
(isofenphos)、祿芬隆(lufenuron)、馬拉硫磷(malathion)、
美氟脞(metaflumizone)、聚乙醛(metaldehyde)、甲胺磷
(methamidophos)、殺撲磷(methidathion)、滅賜克
(methiodicarb)、滅多蟲(methomyl)、美賜年
(methoprene)、甲氧氯(methoxychlor)、甲氧苄氟菊酯
(metofluthrin)、久效磷(monocrotophos)、甲氧蟲醯肼
(methoxyfenozide)、吡蟲胺(nitenpyram)、硝基亞嗪
(nithiazine)、諾華隆(novaluron)、紐伏隆(noviflumuron)、
歐殺滅(oxamyl)、對硫磷(parathion)、甲基對硫磷、百滅
寧(permethrin)、甲拌磷(phorate)、伏殺磷(phosalone)、益
滅松(phosmet)、福賜米松(phosphamidon)、抗蚜威
(pirimicarb)、丙溴磷(profenofos)、丙氟菊酯
(profluthrin)、克蟎特(propargite)、丙苯煙菊酯
(protrifenbute)、派滅淨(pymetrozine)、吡拉氟普
(pyrafluprole)、除蟲菊酯(pyrethrin)、噻蟎靈
(pyridaben)、啉蟲丙醚(pyridalyl)、吡氟喹脞
(pyrifluquinazon)、吡瑞普(pyriprole)、百利普芬
(pyriproxyfen)、魚藤酮(rotenone)、尼魚丁(ryanodine)、
斯平托姆(spinetoram)、賜諾殺(spinosad)、螺蟎酯
(spirodiclofen)、螺甲蟎酯(spiromesifen)、螺蟲乙酯

(spirotetramat) 、 硫 丙 磷 (sulprofos) 、 蟲 醃 肼 (tebufenozide) 、 吡 蟎 胺 (tebufenpyrad) 、 得 福 隆 (teflubenzuron) 、 七 氟 菊 酯 (tefluthrin) 、 託 福 松 (terbufos) 、 殺 蟲 威 (tetrachlorvinphos) 、 胺 菊 酯 (tetramethrin) 、 噠 蟲 啉 (thiacloprid) 、 噠 蟲 嗪 (thiamethoxam) 、 硫 雙 威 (thiodicarb) 、 殺 蟲 雙 (thiosultap-sodium) 、 唑 蟲 醃 胺 (tolfenpyrad) 、 四 溴 菊 酯 (tralomethrin) 、 唑 蚜 威 (triazamate) 、 三 氟 松 (trichlorfon) 、 殺 蟲 隆 (triflumuron) 、 蘇 雲 金 芽 孢 桿 菌 δ -內 毒 素 、 昆 蟲 病 原 細 菌 、 昆 蟲 病 原 病 毒 及 昆 蟲 病 原 真 菌 。

值得注意的為諸如以下各物之殺昆蟲劑：阿巴汀、啶蟲脒、阿納寧、三亞蟎、阿維菌素、印棟素、畢芬寧、3-溴-1-(3-氟-2-吡啶基)-N-[4-氟基-2-甲基-6-[(甲基胺基)羰基]苯基]-1H-吡唑-5-甲醃胺、布芬淨、硫線磷、加保利、殺螟丹、氟蟲醃胺、蟲蟎脒、毒死蜱、可尼丁、賽扶寧、 β -賽扶寧、賽洛寧、 γ -賽洛寧、 λ -賽洛寧、賽滅寧、 α -賽滅寧、 ζ -賽滅寧、賽滅淨、溴氟菊酯、狄氏劑、呋蟲胺、戴芬蘭、因滅汀、硫丹、益化利、乙蟲清、依芬寧、乙蟎唑、芬硫克、芬諾克、芬化利、氟蟲脒、氟尼胺、氟苯地胺、氟芬隆、氟胺氟戊菊酯、複滅蟎、福賽絕、六伏隆、伏蟻脒、益達胺、節蟲威、祿芬隆、美氟脒、滅賜克、滅多蟲、美賜年、甲氧蟲醃肼、吡蟲胺、硝基亞嗪、諾華隆、歐殺滅、派滅淨、除蟲菊酯、噠蟎靈、啶蟲丙醚、百利普芬、尼魚丁、斯平托姆、賜諾殺、螺蟎酯、螺甲蟎

酯、螺蟲乙酯、蟲醃肼、胺菊酯、噻蟲啉、噻蟲嗪、硫雙威、殺蟲雙、四溴菊酯、啞蚜威、殺蟲隆、蘇雲金芽孢桿菌 δ -內毒素、蘇雲金芽孢桿菌之所有菌株及核多角體 (*Nucleo polyhydrosis*) 病毒之所有菌株。

與本發明化合物混合之生物劑之一實施例包括：食蟲細菌，諸如蘇雲金芽孢桿菌及囊封之蘇雲金芽孢桿菌 δ -內毒素，諸如藉由 CellCap® 方法製備之 MVP® 及 MVPII® 生物殺昆蟲劑 (CellCap®、MVP® 及 MVPII® 為 Mycogen Corporation (Indianapolis, Indiana, USA) 之商標)；食蟲真菌，諸如綠僵病真菌；及食蟲病毒 (天然存在病毒與遺傳修飾病毒兩者)，包括桿狀病毒、核多角體病毒 (NPV)，諸如穀實夜蛾核多角體病毒 (HzNPV)、芹菜夜蛾 (*Anagrapha falcifera*) 核多角體病毒 (AfNPV)；及顆粒體病毒 (GV)，諸如蘋果蠹蛾顆粒體病毒 (CpGV)。

尤其值得注意的為其中另一無脊椎害蟲控制活性成份屬於與式 1 化合物不同之化學類別或具有與式 1 化合物不同之作用位點的此類組合。在某些情況下，與至少一種具有類似控制譜但具有不同作用位點之其他無脊椎害蟲控制活性成份的組合將尤其有利於抗性治理。因此，本發明之組合物可進一步包含生物學有效量之至少一種具有類似控制譜但屬於不同化學類別或具有不同作用位點之其他無脊椎害蟲控制活性成份。此等其他生物學活性化合物或藥劑包括 (但不限於)：鈉通道調節劑，諸如畢芬寧、賽滅寧、賽洛寧、 λ -賽洛寧、賽扶寧、 β -賽扶寧、溴氟菊酯、四氟甲醚

菊酯、益化利、芬化利、節蟲威、甲氧苄氟菊酯、丙氟菊酯、除蟲菊酯及四溴菊酯；膽鹼酯酶抑制劑，諸如毒死蜱、滅多蟲、歐殺滅、硫雙威及啞蚜威；新菸鹼類似物，諸如啞蟲脒、可尼丁、呋蟲胺、益達胺、吡蟲胺、硝基亞嗪、噻蟲啉及噻蟲嗪；殺昆蟲大環內酯，諸如斯平托姆、賜諾殺、阿巴汀、阿維菌素及因滅汀；GABA(γ -氨基丁酸)門控氯離子通道拮抗劑，諸如阿維菌素，或阻斷劑，諸如乙蟲清及氟蟲腓；甲殼素合成抑制劑，諸如布芬淨、賽滅淨、氟芬隆、六伏隆、祿芬隆、諾華隆、紐伏隆及殺蟲隆；擬保幼激素，諸如戴芬蘭、芬諾克、美賜年及百利普芬；奧克巴胺(octopamine)受體配位體，諸如三亞蟎；蛻皮抑制劑及蛻皮激素促效劑，諸如印棟素、甲氧蟲醯肼及蟲醯肼；尼魚丁受體配位體，諸如尼魚丁，鄰氨基苯甲酸二醯胺，諸如氟蟲醯胺(參見美國專利6,747,047、PCT公開案WO 2003/015518及WO 2004/067528)及氟苯地胺(參見美國專利6,603,044)；沙蠶毒素(nereistoxin)類似物，諸如殺螟丹；線粒體電子輸送抑制劑，諸如蟲蟎腓、伏蟻脛及噠蟎靈；脂質生物合成抑制劑，諸如螺蟎酯及螺甲蟎酯；環戊二烯類殺昆蟲劑，諸如狄氏劑或硫丹；擬除蟲菊酯(pyrethroid)；氨基甲酸酯；殺昆蟲脲；及生物劑，包括核多角體病毒(NPV)、蘇雲金芽孢桿菌成員、囊封之蘇雲金芽孢桿菌 δ -內毒素及其他天然存在或遺傳修飾之殺昆蟲病毒。

可與本發明之化合物調配之生物學活性化合物或藥劑的

其他實例為：殺真菌劑，諸如苯并噻二唑(acibenzolar)、阿迪嗎啉(aldimorph)、吡唑磺菌胺(amisulbrom)、阿紫康唑(azaconazole)、亞托敏(azoxystrobin)、苯霜靈(benalaxyl)、苯菌靈(benomyl)、苯噻瓦利(benthiavalicarb)、苯噻菌胺(benthiavalicarb-isopropyl)、百諾殺(binomial)、聯苯(biphenyl)、雙苯三唑醇(bitertanol)、滅瘟素(blasticidin-S)、波爾多混合液(Bordeaux mixture)(鹼式硫酸銅)、博克利(boscalid)/尼可必芬(nicobifen)、糠菌唑(bromuconazole)、磺酸丁嘧啶(bupirimate)、丁賽特(buthiobate)、姜鏽靈(carboxin)、加普胺(carpropamid)、四氯丹(captafol)、卡普坦(captan)、貝芬替(carbendazim)、地茂丹(chloroneb)、百菌清(chlorothalonil)、乙菌利(chlozolate)、克微唑(clotrimazole)、氯化銅(copper oxychloride)、銅鹽(諸如，硫酸銅及氫氧化銅)、賽座滅(cyazofamid)、環氟菌胺(cyflunamid)、霜脈氟(cymoxanil)、環克唑(cyproconazole)、賽普洛(cyprodinil)、益發靈(dichlofluanid)、二氯西莫(diclocymet)、噻菌清(diclomezine)、氯硝胺(dicloran)、乙微威(diethofencarb)、苯醚甲環唑(difenoconazole)、達滅芬(dimethomorph)、醚菌胺(dimoxystrobin)、達克利(diniconazole)、達克利-M(diniconazole-M)、白粉克(dinocap)、迪克曲濱(discostrobin)、腈硫醌(dithianon)、嗎菌靈(dodemorph)、多寧(dodine)、益康唑(econazole)、

乙環唑 (etaconazole)、護粒松 (edifenphos)、氟環唑 (epoxiconazole)、乙噻博胺 (ethaboxam)、乙菌啉 (ethirimol)、土菌靈 (ethridiazole)、噁唑菌酮 (famoxadone)、咪唑菌酮 (fenamidone)、芬瑞莫 (fenarimol)、芬布康唑 (fenbuconazole)、芬卡咪得 (fencaramid)、甲呋醯胺 (fenfuram)、芬己醯胺 (fenhexamide)、禾草靈 (fenoxanil)、拌種咯 (feniclonil)、苯鏽啉 (fenpropidin)、粉鏽啉 (fenpropimorph)、三苯醋錫 (fentin acetate)、三苯基氫氧化錫 (fentin hydroxide)、福美鐵 (ferbam)、芬福唑 (ferfurazoate)、嘍菌脞 (ferimzone)、扶吉胺 (fluazinam)、護汰寧 (fludioxonil)、氟美醯胺 (flumetover)、氟吡菌胺 (fluopicolide)、氟氧菌胺 (fluoxastrobin)、氟奎康唑 (fluquinconazole)、氟奎康唑、護矽得 (flusilazole)、磺菌胺 (flusulfamide)、氟多寧 (flutolanil)、護汰芬 (flutriafol)、福爾培 (folpet)、乙磷鋁 (fosetyl-aluminum)、麥穗靈 (fuberidazole)、呋霜靈 (furalaxyl)、福拉比 (furametapyr)、六康唑 (hexaconazole)、惡微靈 (hymexazole)、雙胍鹽 (guazatine)、依滅列 (imazalil)、易胺座 (imibenconazole)、雙胍辛胺 (iminocadine)、依卡博 (iodicarb)、依普克唑 (ipconazole)、丙基喜樂松 (iprobenfos)、依普同 (iprodone)、纈微威 (iprovalicarb)、異康唑 (isoconazole)、稻瘟靈 (isoprothiolane)、春日黴素 (kasugamycin)、克收欣 (kresoxim-methyl)、錳粉克 (mancozeb)、雙炔醯菌胺

(mandipropamid) 、 錳 乃 浦 (maneb) 、 噻 菌 胺 (mapanipyrin) 、 甲 霜 靈 (mefenoxam) 、 滅 鏽 胺 (mepronil) 、 滅 達 樂 (metalaxyl) 、 葉 菌 唑 (metconazole) 、 磺 菌 威 (methasulfocarb) 、 代 森 聯 (metiram) 、 甲 氧 亞 胺 菌 酯 (metominostrobin)/ 苯 氧 菌 胺 (fenominostrobin) 、 滅 派 林 (mepanipyrim) 、 美 曲 芬 諾 (metrafenone) 、 咪 康 唑 (miconazole) 、 腈 菌 唑 (myclobutanil) 、 新 阿 蘇 仁 (neo-asozin)(甲 基 砷 酸 鐵 (ferric methanearsonate)) 、 尼 瑞 莫 (nuarimol) 、 辛 噻 酮 (octhilinone) 、 呋 醯 胺 (ofurace) 、 奧 瑞 菌 胺 (orysastrobin) 、 歐 殺 斯 (oxadixyl) 、 奧 索 利 酸 (oxolinic acid) 、 噁 咪 唑 (oxpoconazole) 、 氧 化 姜 鏽 靈 (oxycarboxin) 、 巴 克 素 (paclobutrazol) 、 平 克 唑 (penconazole) 、 賓 克 隆 (pencycuron) 、 吡 噻 菌 胺 (penthioapyrad) 、 培 氟 甲 酸 鹽 (perfurazoate) 、 膦 酸 、 苯 酞 (phthalide) 、 匹 克 苯 甲 咪 (picobenzamid) 、 啞 氧 菌 胺 (picoxystrobin) 、 多 氧 菌 素 (polyoxin) 、 噻 菌 靈 (probenazole) 、 撲 克 拉 (prochloraz) 、 撲 滅 寧 (procymidone) 、 霜 徽 威 (propamocarb) 、 霜 徽 威 鹽 酸 鹽 、 普 克 利 (propiconazole) 、 甲 基 鋅 乃 浦 (propineb) 、 普 奎 那 茲 (proquinazid) 、 普 硫 康 唑 (prothioconazole) 、 百 克 敏 (pyraclostrobin) 、 白 粉 松 (pyrazophos) 、 比 芬 諾 (pyrifenoxy) 、 派 美 尼 (pyrimethanil) 、 比 芬 諾 、 吡 咯 尼 群 (pyrolnitrine) 、 咯 嗒 酮 (pyroquilon) 、 嗒 唑 (quinconazole) 、 快 諾 芬 (quinoxifen) 、 奎 脫 辛 (quintozene) 、 矽 硫 芬

(silthiofam)、矽氣唑(simeconazole)、螺環菌胺(spiroxamine)、鏈黴素(streptomycin)、硫、得克利(tebuconazole)、替克拉(techrazene)、克枯爛(tecloftalam)、四氣硝基苯(tecnazene)、氣醚唑(tetraconazole)、噻苯咪唑(thiabendazole)、噻氣菌胺(thifluzamide)、硫菌靈(thiophanate)、甲基硫菌靈、福美雙(thiram)、汰敵寧(tiadinil)、甲基-脫克松(tolclofos-methyl)、甲苯氟磺胺(tolyfluanid)、三泰芬(triadimefon)、三泰隆(triadimenol)、噻菌醇(triarimol)、咪唑嗪(triazoxide)、三得芬(tridemorph)、三嗎啉醯胺(trimoprhamide)、三賽唑(tricyclazole)、三氟敏(trifloxystrobin)、賽福寧(triforine)、環菌唑(triticonazole)、烯效唑(uniconazole)、維利黴素(validamycin)、免克寧(vinclozolin)、鋅乃浦(zineb)、福美鋅(ziram)及氣苯醯胺(zoxamide)；殺線蟲劑，諸如涕滅威(aldicarb)、咪克芬(imicyafos)、歐殺滅及芬滅松(fenamiphos)；殺菌劑，諸如鏈黴素(streptomycin)；殺蟎劑，諸如三亞蟎、滅蟎猛(chinomethionat)、殺蟎酯(chlorobenzilate)、環己錫(cyhexatin)、大克蟎(dicofol)、得氣蟎(dienochlor)、乙蟎唑、喹蟎醚(fenazaquin)、苯丁錫、芬普寧、芬普蟎(fenpyroximate)、噻蟎酮、克蟎特、噠蟎靈及吡蟎胺。

在某些情況下，本發明之化合物與其他生物學活性(尤其無脊椎害蟲控制)化合物或藥劑(亦即，活性成份)之組合

可產生大於累加(亦即，協同)效應。始終需要降低釋放於環境中之活性成份之量，同時確保有效害蟲控制。當在得到農藝上令人滿意之無脊椎害蟲控制程度之施用率下發生無脊椎害蟲控制活性成份之協同作用時，該等組合可有利於降低作物生產成本且降低環境負荷。

本發明之化合物及其組合物可施用於經遺傳轉型以表現對無脊椎害蟲有毒之蛋白質(諸如蘇雲金芽孢桿菌 δ -內毒素)之植物。此施用可提供更寬範圍之植物保護且有利於抗性處理。外源性施用之本發明無脊椎害蟲控制化合物的作用可與所表現之毒素蛋白質協同作用。

此等農業保護劑(亦即，殺昆蟲劑、殺真菌劑、殺線蟲劑、殺蟎劑、除草劑及生物劑)之一般參考文獻包括 *The Pesticide Manual*，第13版，C. D. S. Tomlin編，British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003及 *The BioPesticide Manual*，第2版，L. G. Copping，編，British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001。

對於使用此等多種混合搭配物中之一或多者的實施例，此等多種混合搭配物(總計)與式1化合物之重量比通常在約1:3000與約3000:1之間。值得注意的為約1:300與約300:1之間之重量比(例如約1:30與約30:1之間的比率)。熟習此項技術者經由簡單實驗可輕易決定達成所要生物活性範圍所需之活性成份之生物學有效量。顯然，包括此等其他組份可擴展受控制之無脊椎害蟲範圍超過僅由式1化合物控制之無脊椎害蟲範圍。

表A列出式1化合物與其他無脊椎害蟲控制劑之特定組合以說明本發明之混合物、組合物及方法。表A之第一行列出特定無脊椎害蟲控制劑(例如第一列中之「阿巴汀」)。表A之第二行列出無脊椎害蟲控制劑之作用模式(若已知)或化學類別。表A之第三行列出無脊椎害蟲控制劑相對於式1化合物可施用率的重量比範圍之實施例(例如,以重量計,阿巴汀相對於式1化合物「50:1至1:50」)。因此,舉例而言,表A之第一列特定揭示式1化合物與阿巴汀之組合可以50:1至1:50之間之重量比施用。表A之其餘列可類似理解。另外注意表A列出式1化合物與其他無脊椎害蟲控制劑之特定組合以說明本發明之混合物、組合物及方法,且包括施用率之重量比範圍的其他實施例。

表 A

無脊椎害蟲控制劑	作用模式或化學類別	典型重量比
阿巴汀	大環內酯	50:1至1:50
啶蟲脒	新菸鹼類似物	150:1至1:200
三亞蟎	奧克巴胺受體配位體	200:1至1:100
阿維菌素	大環內酯	50:1至1:50
印楝素	蛻皮激素促效劑	100:1至1:120
B-賽扶寧	鈉通道調節劑	150:1至1:200
畢芬寧	鈉通道調節劑	100:1至1:10
布芬淨	甲殼素合成抑制劑	500:1至1:50
殺螟丹	沙蠶毒素類似物	100:1至1:200
氣蟲醯胺	尼魚丁受體配位體	100:1至1:120
蟲蟎腈	線粒體電子輸送抑制劑	300:1至1:200
毒死蜱	膽鹼酯酶抑制劑	500:1至1:200
可尼丁	新菸鹼類似物	100:1至1:400
賽扶寧	鈉通道調節劑	150:1至1:200
賽洛寧	鈉通道調節劑	150:1至1:200
賽滅寧	鈉通道調節劑	150:1至1:200
賽滅淨	甲殼素合成抑制劑	400:1至1:50
溴氟菊酯	鈉通道調節劑	50:1至1:400

無脊椎害蟲控制劑	作用模式或化學類別	典型重量比
狄氏劑	環戊二烯類殺昆蟲劑	200:1至1:100
呋蟲胺	新菸鹼類似物	150:1至1:200
戴芬蘭	蛻皮抑制劑	150:1至1:200
因滅汀	大環內酯	50:1至1:10
硫丹	環戊二烯類殺昆蟲劑	200:1至1:100
益化利	鈉通道調節劑	100:1至1:400
乙蟲清	GABA調節之氯離子通道阻斷劑	200:1至1:100
芬硫克		150:1至1:200
芬諾克	擬保幼激素	500:1至1:100
芬化利	鈉通道調節劑	150:1至1:200
氟蟲腓	GABA調節之氯離子通道阻斷劑	150:1至1:100
氟尼胺		200:1至1:100
氟苯地胺	尼魚丁受體配位體	100:1至1:120
氟芬隆	甲殼素合成抑制劑	200:1至1:100
六伏隆	甲殼素合成抑制劑	300:1至1:50
伏蟻脞	線粒體電子輸送抑制劑	150:1至1:250
益達胺	新菸鹼類似物	1000:1至1:1000
茆蟲威	鈉通道調節劑	200:1至1:50
λ-賽洛寧	鈉通道調節劑	50:1至1:250
祿芬隆	甲殼素合成抑制劑	500:1至1:250
美氟脞		200:1至1:200
滅多蟲	膽鹼酯酶抑制劑	500:1至1:100
美賜年	擬保幼激素	500:1至1:100
甲氧蟲醯肼	蛻皮激素促效劑	50:1至1:50
吡蟲胺	新菸鹼類似物	150:1至1:200
硝基亞嗪	新菸鹼類似物	150:1至1:200
諾華隆	甲殼素合成抑制劑	500:1至1:150
歐殺滅	膽鹼酯酶抑制劑	200:1至1:200
派滅淨		200:1至1:100
除蟲菊酯	鈉通道調節劑	100:1至1:10
噠蟊靈	線粒體電子輸送抑制劑	200:1至1:100
啞蟲丙醚		200:1至1:100
百利普芬	擬保幼激素	500:1至1:100
尼魚丁	尼魚丁受體配位體	100:1至1:120
斯平托姆	大環內酯	150:1至1:100
賜諾殺	大環內酯	500:1至1:10
螺蟊酯	脂質生物合成抑制劑	200:1至1:200
螺甲蟊酯	脂質生物合成抑制劑	200:1至1:200
蟲醯肼	蛻皮激素促效劑	500:1至1:250
噠蟲啉	新菸鹼類似物	100:1至1:200
噠蟲嗪	新菸鹼類似物	1250:1至1:1000
硫雙威	膽鹼酯酶抑制劑	500:1至1:400
殺蟲雙		150:1至1:100

無脊椎害蟲控制劑	作用模式或化學類別	典型重量比
四溴菊酯	鈉通道調節劑	150:1至1:200
啞蚜威	膽鹼酯酶抑制劑	250:1至1:100
殺蟲隆	甲殼素合成抑制劑	200:1至1:100
蘇雲金芽孢桿菌	生物劑	50:1至1:10
蘇雲金芽孢桿菌 δ -內毒素	生物劑	50:1至1:10
NPV(例如Gemstar)	生物劑	50:1至1:10
(a)	尼魚丁受體配位體	100:1至1:120

(a) 3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氟基-2-甲基-6-[(甲基胺基)羰基]苯基]-1H-吡唑-5-甲醯胺

值得注意的為其中至少一種其他生物學活性化合物或藥劑係選自上表A中列出之無脊椎害蟲控制劑的本發明之組合物。

化合物(包括式1化合物)與其他無脊椎害蟲控制劑之重量比通常在1000:1與1:1000之間，其中一實施例在500:1與1:500之間，另一實施例在250:1與1:200之間，且另一實施例在100:1與1:50之間。

下表B中列出包含式1化合物(化合物編號係指索引表A-I中之化合物)及另一無脊椎害蟲控制劑之特定組合物的實施例。

表 B

混合物編號	化合物編號	與	無脊椎害蟲控制劑	混合物編號	化合物編號	與	無脊椎害蟲控制劑
A-1	7	與	阿巴汀	B-1	50	與	阿巴汀
A-2	7	與	啞蟲脒	B-2	50	與	啞蟲脒
A-3	7	與	三亞蟎	B-3	50	與	三亞蟎
A-4	7	與	阿維菌素	B-4	50	與	阿維菌素
A-5	7	與	印棟素	B-5	50	與	印棟素
A-6	7	與	β -賽扶寧	B-6	50	與	β -賽扶寧

混合物 編號	化合 物編 號	與	無脊椎害蟲 控制劑	混合物 編號	化合 物編 號	與	無脊椎害蟲 控制劑
A-7	7	與	畢芬寧	B-7	50	與	畢芬寧
A-8	7	與	布芬淨	B-8	50	與	布芬淨
A-9	7	與	殺螟丹	B-9	50	與	殺螟丹
A-10	7	與	氣蟲醯胺	B-10	50	與	氣蟲醯胺
A-11	7	與	蟲蟊睛	B-11	50	與	蟲蟊睛
A-12	7	與	毒死婢	B-12	50	與	毒死婢
A-13	7	與	可尼丁	B-13	50	與	可尼丁
A-14	7	與	賽扶寧	B-14	50	與	賽扶寧
A-15	7	與	賽洛寧	B-15	50	與	賽洛寧
A-16	7	與	賽滅寧	B-16	50	與	賽滅寧
A-17	7	與	賽滅淨	B-17	50	與	賽滅淨
A-18	7	與	溴氣菊酯	B-18	50	與	溴氣菊酯
A-19	7	與	狄氏劑	B-19	50	與	狄氏劑
A-20	7	與	味蟲胺	B-20	50	與	味蟲胺
A-21	7	與	戴芬蘭	B-21	50	與	戴芬蘭
A-22	7	與	因滅汀	B-22	50	與	因滅汀
A-23	7	與	硫丹	B-23	50	與	硫丹
A-24	7	與	益化利	B-24	50	與	益化利
A-25	7	與	乙蟲清	B-25	50	與	乙蟲清
A-26	7	與	芬硫克	B-26	50	與	芬硫克
A-27	7	與	芬諾克	B-27	50	與	芬諾克
A-28	7	與	芬化利	B-28	50	與	芬化利
A-29	7	與	氣蟲睛	B-29	50	與	氣蟲睛
A-30	7	與	氣尼胺	B-30	50	與	氣尼胺
A-31	7	與	氣苯地胺	B-31	50	與	氣苯地胺
A-32	7	與	氣芬隆	B-32	50	與	氣芬隆
A-33	7	與	六伏隆	B-33	50	與	六伏隆
A-34	7	與	伏蟻脛	B-34	50	與	伏蟻脛
A-35	7	與	益達胺	B-35	50	與	益達胺
A-36	7	與	節蟲威	B-36	50	與	節蟲威
A-37	7	與	λ-賽洛寧	B-37	50	與	λ-賽洛寧
A-38	7	與	祿芬隆	B-38	50	與	祿芬隆
A-39	7	與	美氣脛	B-39	50	與	美氣脛
A-40	7	與	滅多蟲	B-40	50	與	滅多蟲
A-41	7	與	美賜年	B-41	50	與	美賜年
A-42	7	與	甲氧蟲醯肼	B-42	50	與	甲氧蟲醯肼
A-43	7	與	吡蟲胺	B-43	50	與	吡蟲胺
A-44	7	與	硝基亞嗪	B-44	50	與	硝基亞嗪
A-45	7	與	諾華隆	B-45	50	與	諾華隆
A-46	7	與	歐殺滅	B-46	50	與	歐殺滅
A-47	7	與	派滅淨	B-47	50	與	派滅淨
A-48	7	與	除蟲菊酯	B-48	50	與	除蟲菊酯

混合物 編號	化合 物編 號	與	無脊椎害蟲 控制劑	混合物 編號	化合 物編 號	與	無脊椎害蟲 控制劑
A-49	7	與	噠蟎靈	B-49	50	與	噠蟎靈
A-50	7	與	啖蟲丙醚	B-50	50	與	啖蟲丙醚
A-51	7	與	百利普芬	B-51	50	與	百利普芬
A-52	7	與	尼魚丁	B-52	50	與	尼魚丁
A-53	7	與	斯平托姆	B-53	50	與	斯平托姆
A-54	7	與	賜諾殺	B-54	50	與	賜諾殺
A-55	7	與	螺蟎酯	B-55	50	與	螺蟎酯
A-56	7	與	螺甲蟎酯	B-56	50	與	螺甲蟎酯
A-57	7	與	蟲醯肼	B-57	50	與	蟲醯肼
A-58	7	與	噠蟲啉	B-58	50	與	噠蟲啉
A-59	7	與	噠蟲嗪	B-59	50	與	噠蟲嗪
A-60	7	與	硫雙威	B-60	50	與	硫雙威
A-61	7	與	殺蟲雙	B-61	50	與	殺蟲雙
A-62	7	與	四溴菊酯	B-62	50	與	四溴菊酯
A-63	7	與	啞蚜威	B-63	50	與	啞蚜威
A-64	7	與	殺蟲隆	B-64	50	與	殺蟲隆
A-65	7	與	蘇雲金芽孢桿菌	B-65	50	與	蘇雲金芽孢桿菌
A-66	7	與	蘇雲金芽孢桿菌 δ -內毒素	B-66	50	與	蘇雲金芽孢桿菌 δ -內毒素
A-67	7	與	NPV(例如 , Gemstar)	B-67	50	與	NPV 例 如 , Gemstar)
A-68	7	與	(a)	B-68	50	與	(a)
C-1	138	與	阿巴汀	D-1	157	與	阿巴汀
C-2	138	與	啖蟲脒	D-2	157	與	啖蟲脒
C-3	138	與	三亞蟎	D-3	157	與	三亞蟎
C-4	138	與	阿維菌素	D-4	157	與	阿維菌素
C-5	138	與	印棟素	D-5	157	與	印棟素
C-6	138	與	β -賽扶寧	D-6	157	與	β -賽扶寧
C-7	138	與	畢芬寧	D-7	157	與	畢芬寧
C-8	138	與	布芬淨	D-8	157	與	布芬淨
C-9	138	與	殺螟丹	D-9	157	與	殺螟丹
C-10	138	與	氣蟲醯胺	D-10	157	與	氣蟲醯胺
C-11	138	與	蟲蟎脒	D-11	157	與	蟲蟎脒
C-12	138	與	毒死婢	D-12	157	與	毒死婢
C-13	138	與	可尼丁	D-13	157	與	可尼丁
C-14	138	與	賽扶寧	D-14	157	與	賽扶寧
C-15	138	與	賽洛寧	D-15	157	與	賽洛寧
C-16	138	與	賽滅寧	D-16	157	與	賽滅寧
C-17	138	與	賽滅淨	D-17	157	與	賽滅淨
C-18	138	與	溴氰菊酯	D-18	157	與	溴氰菊酯
C-19	138	與	狄氏劑	D-19	157	與	狄氏劑
C-20	138	與	味蟲胺	D-20	157	與	味蟲胺

混合物 編號	化合 物編 號	與	無脊椎害蟲 控制劑	混合物 編號	化合 物編 號	與	無脊椎害蟲 控制劑
C-21	138	與	戴芬蘭	D-21	157	與	戴芬蘭
C-22	138	與	因滅汀	D-22	157	與	因滅汀
C-23	138	與	硫丹	D-23	157	與	硫丹
C-24	138	與	益化利	D-24	157	與	益化利
C-25	138	與	乙蟲清	D-25	157	與	乙蟲清
C-26	138	與	芬硫克	D-26	157	與	芬硫克
C-27	138	與	芬諾克	D-27	157	與	芬諾克
C-28	138	與	芬化利	D-28	157	與	芬化利
C-29	138	與	氟蟲腓	D-29	157	與	氟蟲腓
C-30	138	與	氟尼胺	D-30	157	與	氟尼胺
C-31	138	與	氟苯地胺	D-31	157	與	氟苯地胺
C-32	138	與	氟芬隆	D-32	157	與	氟芬隆
C-33	138	與	六伏隆	D-33	157	與	六伏隆
C-34	138	與	伏蟻脞	D-34	157	與	伏蟻脞
C-35	138	與	益達胺	D-35	157	與	益達胺
C-36	138	與	節蟲威	D-36	157	與	節蟲威
C-37	138	與	λ-賽洛寧	D-37	157	與	λ-賽洛寧
C-38	138	與	祿芬隆	D-38	157	與	祿芬隆
C-39	138	與	美氟脞	D-39	157	與	美氟脞
C-40	138	與	滅多蟲	D-40	157	與	滅多蟲
C-41	138	與	美賜年	D-41	157	與	美賜年
C-42	138	與	甲氧蟲醃肼	D-42	157	與	甲氧蟲醃肼
C-43	138	與	吡蟲胺	D-43	157	與	吡蟲胺
C-44	138	與	硝基亞嗪	D-44	157	與	硝基亞嗪
C-45	138	與	諾華隆	D-45	157	與	諾華隆
C-46	138	與	歐殺滅	D-46	157	與	歐殺滅
C-47	138	與	派滅淨	D-47	157	與	派滅淨
C-48	138	與	除蟲菊酯	D-48	157	與	除蟲菊酯
C-49	138	與	噠蟊靈	D-49	157	與	噠蟊靈
C-50	138	與	啞蟲丙醚	D-50	157	與	啞蟲丙醚
C-51	138	與	百利普芬	D-51	157	與	百利普芬
C-52	138	與	尼魚丁	D-52	157	與	尼魚丁
C-53	138	與	斯平托姆	D-53	157	與	斯平托姆
C-54	138	與	賜諾殺	D-54	157	與	賜諾殺
C-55	138	與	螺蟊酯	D-55	157	與	螺蟊酯
C-56	138	與	螺甲蟊酯	D-56	157	與	螺甲蟊酯
C-57	138	與	蟲醃肼	D-57	157	與	蟲醃肼
C-58	138	與	噻蟲啉	D-58	157	與	噻蟲啉
C-59	138	與	噻蟲嗪	D-59	157	與	噻蟲嗪
C-60	138	與	硫雙威	D-60	157	與	硫雙威
C-61	138	與	殺蟲雙	D-61	157	與	殺蟲雙
C-62	138	與	四溴菊酯	D-62	157	與	四溴菊酯

混合物 編號	化合 物編 號	與	無脊椎害蟲 控制劑	混合物 編號	化合 物編 號	與	無脊椎害蟲 控制劑
C-63	138	與	啞蚜威	D-63	157	與	啞蚜威
C-64	138	與	殺蟲隆	D-64	157	與	殺蟲隆
C-65	138	與	蘇雲金芽孢桿菌	D-65	157	與	蘇雲金芽孢桿菌
C-66	138	與	蘇雲金芽孢桿菌 δ -內毒素	D-66	157	與	蘇雲金芽孢桿菌 δ -內毒素
C-67	138	與	NPV(例如， Gemstar)	D-67	157	與	NPV(例如， Gemstar)
C-68	138	與	(a)	D-68	157	與	(a)

(a) 3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氟基-2-甲基-6-[(甲基胺基)羰基]苯基]-1H-吡唑-5-甲醯胺

表B中列出之特定混合物通常以表A中指定之比率組合式1化合物與另一無脊椎害蟲藥劑。

在農藝及非農藝應用中，藉由將生物學有效量之一或多種本發明之化合物(通常呈組合物形式)施用至害蟲環境(包括農藝及/或非農藝侵染地點)、有待保護之區域或直接施用至有待控制之害蟲來控制無脊椎害蟲。

因此，本發明包含一種用於在農藝及/或非農藝應用中控制無脊椎害蟲之方法，其包含使該無脊椎害蟲或其環境與生物學上有效量之一或多種本發明化合物接觸，或與包含至少一種該化合物之組合物，或包含至少一種該化合物及生物學有效量之至少一種其他生物學活性化合物或藥劑的組合物接觸。包含本發明化合物及生物學有效量之至少一種其他生物學活性化合物或藥劑的合適組合物之實例包括顆粒組合物，其中其他活性化合物存在於與本發明化合物相同之顆粒上或存在於獨立於本發明化合物所存在之彼

等顆粒之顆粒上。

為達成與本發明之化合物或組合物接觸以保護農作物免遭無脊椎害蟲侵襲，該化合物或組合物通常施用於種植之前的作物種子、作物植物之葉枝(例如，葉、莖、花、果實)或作物種植之前或之後的土壤或其他生長介質。

接觸方法之一實施例係藉由噴霧。或者，包含本發明化合物之顆粒組合物可施用於植物葉枝或土壤。本發明之化合物亦可經由藉由使植物與作為液體調配物、顆粒調配物之土壤澆灌液施用於土壤的包含本發明化合物之組合物接觸而被植物吸收、育苗盒處理或移植物浸漬來有效傳遞。值得注意的為呈土壤澆灌液體調配物形式之本發明之組合物。亦值得注意的為一種用於控制無脊椎害蟲之方法，其包含使無脊椎害蟲或其環境與生物學有效量之本發明化合物或與包含物學有效量之本發明化合物之組合物接觸。進一步值得注意的為其中環境為土壤且組合物係以土壤澆灌液調配物形式施用於土壤之此方法。進一步值得注意的為本發明之化合物藉由向侵染地點局部施用亦為有效的。其他接觸方法包括藉由直接及滯留性噴霧、空中噴霧、凝膠、種子塗佈、微囊封、系統性吸收、誘餌、耳標、大丸劑、噴霧器、煙熏劑、氣霧劑、粉劑及許多其他方法施用本發明之化合物或組合物。接觸方法之一實施例為包含本發明之化合物或組合物之尺寸穩定的肥料顆粒、棒或錠劑。本發明之化合物亦可注入用於製造無脊椎動物控制裝置(例如，昆蟲網)之材料中。

本發明之化合物亦可用於種子處理以保護種子免遭無脊椎害蟲侵襲。在本揭示案及申請專利範圍之上下文中，處理種子意謂使該種子與通常調配為本發明之組合物的生物學有效量之本發明化合物接觸。此種子處理保護種子免遭無脊椎土壤害蟲侵襲且一般亦可保護由發芽種子發育之秧苗之根及與土壤接觸的其他植物部分。種子處理亦可藉由本發明之化合物或第二活性成份在發育中植物內遷移而提供對葉枝之保護。種子處理可應用於所有類型之種子，包括將萌發出經遺傳轉型以表現特殊特性之植物的彼等種子。代表性實例包括表現對無脊椎害蟲有毒之蛋白質(諸如，蘇雲金芽孢桿菌毒素)的彼等種子，或表現除草劑抵抗物(諸如草甘膦乙醯基轉移酶(其提供對草甘膦之抗性))之彼等種子。

一種種子處理方法係藉由在播撒種子之前以本發明之化合物(亦即，呈調配組合物形式)向種子噴霧或噴撒。經調配用於種子處理之組合物一般包含成膜劑或黏著劑。因此，本發明之種子塗佈組合物通常包含生物學有效量之式1化合物及成膜劑或黏著劑。種子可藉由將可流動懸浮液濃縮物直接噴霧至種子滾動床中且接著使該等種子乾燥來塗佈。或者，諸如濕潤散劑、溶液、懸浮乳液、可乳化濃縮物及於水中之乳液之其他調配物類型可噴霧於種子上。此方法尤其適用於將膜塗層施用於種子上。熟習此項技術者可利用各種塗佈機及塗佈方法。合適方法包括P. Kusters等人，*Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC

專題論文57號及其中列出之參考文獻中列出之彼等方法。

經處理之種子通常包含每100 kg種子約0.1 g至1 kg(亦即，處理前種子之約0.0001重量%至1重量%)之量的本發明化合物。經調配用於種子處理之可流動懸浮液通常包含約0.5%至約70%之活性成份、約0.5%至約30%之成膜黏著劑、約0.5%至約20%之分散劑、0%至約5%之稠化劑、0%至約5%之顏料及/或染料、0%至約2%之消泡劑、0%至約1%之防腐劑及0%至約75%之揮發性液體稀釋劑。

本發明之化合物可併入為無脊椎害蟲取食或在諸如陷阱、誘餌台及其類似物之裝置中使用之誘餌組合物中。此類誘餌組合物可呈顆粒形式，其包含：(a)活性成份，亦即生物學有效量之式1化合物；(b)一或多種食物材料；視情況之(c)引誘劑；及視情況之(d)一或多種保濕劑。值得注意的為包含約0.001%-5%之間的活性成份、約40%-99%食物材料及/或引誘劑及視情況約0.05%-10%保濕劑之顆粒或誘餌組合物，其在極低施用率下、尤其在藉由攝取而非藉由直接接觸而致命的活性成份劑量下，可有效控制土壤無脊椎害蟲。一些食物材料可充當食物源與引誘劑兩者。食物材料包括碳水化合物、蛋白質及脂質。食物材料之實例為植物粉、糖、澱粉、動物脂肪、植物油、酵母萃取物及乳固體。引誘劑之實例為加味劑及芳香劑，諸如水果或植物萃取物、香料或其他動物或植物組份、信息素或已知吸引目標無脊椎害蟲之其他試劑。保濕劑(亦即，濕度保持劑)之實例為二醇及其他多元醇、甘油及山梨糖醇。值得

注意的為一種用以控制至少一種選自由螞蟻、白蟻及蟑螂組成之群之無脊椎害蟲的誘餌組合物(及一種利用此類誘餌組合物之方法)。一種用於控制無脊椎害蟲之裝置可包含本發明之誘餌組合物及適合於收納該誘餌組合物之外殼，其中該外殼具有至少一個開口，該開口之尺寸訂定為允許該無脊椎害蟲通過該開口，因此該無脊椎害蟲可自外殼外部之位置接近該誘餌組合物，且其中該外殼進一步適合於置放在無脊椎害蟲之潛在或已知活動地點或其附近。

本發明之化合物可在無其他佐劑的情況下施用，但最通常施用包含一或多種活性成份及合適載劑、稀釋劑及界面活性劑且視預期最終用途而定可能與食物組合之調配物。一種施用方法包括將本發明化合物之水分散液或精製油溶液噴霧。與噴霧油、噴霧油濃縮物、黏展劑、佐劑、其他溶劑及諸如向日葵基丁氧化物之增效劑組合通常增強化合物功效。對於非農藝用途而言，該等噴霧可自諸如罐、瓶或其他容器之噴霧容器藉助於泵或藉由使其自加壓容器(例如，加壓氣霧劑噴霧罐)釋放而施用。該等噴霧組合物可採用多種形式，例如噴霧、薄霧、泡沫、煙霧或霧。因此，視應用需要，該等噴霧組合物可進一步包含推進劑、發泡劑等。值得注意的為包含生物學有效量之本發明之化合物或組合物及載劑的噴霧組合物。此類噴霧組合物之一實施例包含生物學有效量之本發明之化合物或組合物及推進劑。代表性推進劑包括(但不限於)甲烷、乙烷、丙烷、丁烷、異丁烷、丁烯、戊烷、異戊烷、新戊烷、戊烯、氫

氟碳化物、氯氟碳化物、二甲醚及前述物質之混合物。值得注意的為一種用以控制至少一種選自由以下各害蟲組成之群之無脊椎害蟲的噴霧組合物(及一種利用自噴霧容器施配之此類噴霧組合物的方法): 蚊子、黑蠅、廢蠅、鹿蠅、馬蠅、胡蜂、小黃蜂、大黃蜂、蟬、蜘蛛、螞蟻、蚋及其類似害蟲, 包括個別或組合。

非農藝用途係指在除作物植物領域外之區域中的無脊椎害蟲控制。本發明之化合物及組合物之非農藝用途包括儲存之穀物、豆類及其他糧食中及諸如衣服及地毯之織物中的無脊椎害蟲控制。本發明之化合物及組合物之非農藝用途亦包括在觀賞植物、森林中、在庭院中、路旁及鐵路築路用地旁及在諸如草地、高爾夫球場及牧場之草皮上的無脊椎害蟲控制。本發明之化合物及組合物之非農藝用途亦包括在可由人類及/或伴侶動物、家畜、農場動物、動物園動物或其他動物居住之房屋及其他建築物中的無脊椎害蟲控制。本發明之化合物及組合物之非農藝用途亦包括控制可破壞木材或建築物中使用之其他結構材料的害蟲, 諸如白蟻。

本發明之化合物及組合物之非農藝用途亦包括藉由控制寄生性或傳播侵染性疾病之無脊椎害蟲來保護人類與動物之健康。動物寄生蟲之控制包括控制寄生在宿主動物身體表面(例如, 肩膀、腋窩、腹部、大腿內側部分)之外寄生蟲及寄生在宿主動物身體內部(例如, 胃、腸、肺、靜脈、皮膚下、淋巴組織)之內寄生蟲。外寄生性或疾病傳

播害蟲包括(例如)恙蟎、蜚、虱、蚊子、蒼蠅、蟎及跳蚤。內寄生蟲包括犬惡絲蟲、鉤蟲及蠕蟲。本發明之化合物及組合物尤其適於對抗外寄生性或疾病傳播害蟲。本發明之化合物及組合物適於系統性及/或非系統性控制動物上寄生蟲之侵染或感染。

本發明之化合物及組合物適於對抗侵染動物受檢者之寄生蟲，該等動物受檢者包括野生動物、家畜及農業勞動動物中之彼等動物受檢者，諸如牛、綿羊、山羊、馬、豬、驢、駱駝、野牛、水牛、兔、母雞、火雞、鴨、鵝及蜜蜂(例如，出於肉、乳、乳酪、蛋、毛皮、皮革、羽毛及/或羊毛之目的而飼養)。藉由對抗寄生蟲，死亡率及效能下降(根據肉、乳、羊毛、皮、蛋、蜂蜜等)得以降低，因此施用包含本發明化合物之組合物允許更經濟且簡單地飼養動物。

本發明之化合物及組合物尤其適於對抗侵染伴侶動物及寵物(例如，狗、貓、寵物鳥及觀賞魚)、研究及實驗動物(例如，倉鼠、豚鼠、大鼠及小鼠)以及動物園、野生棲息地及/或馬戲團中飼養之動物的寄生蟲。

在本發明之一實施例中，動物較佳為脊椎動物，且更佳為哺乳動物、鳥或魚。在一特定實施例中，動物受檢者為哺乳動物(包括類人猿，諸如人類)。其他哺乳動物受檢者包括靈長類動物(例如，猴)、牛科動物(例如，畜牛或奶牛)、豬科動物(例如，家豬或豬)、綿羊科動物(例如，山羊或綿羊)、馬科動物(例如，馬)、犬科動物(例如，狗)、

貓科動物(例如，家貓)、駱駝、鹿、驢、野牛、水牛、羚羊、兔及齧齒動物(例如，豚鼠、松鼠、大鼠、小鼠、沙鼠及倉鼠)。鳥類包括鴨科(Anatidae)(天鵝、鴨及鵝)、鳩鴿科(Columbidae)(例如，斑鳩及鴿子)、雉科(Phasianidae)(例如，鷓鴣、松雞及火雞)、Thesienidae(例如，家雞)、鸚鵡科(例如，長尾鸚鵡、金剛鸚鵡及鸚鵡)、獵禽及平胸類鳥(例如，鴛鴦)。

經本發明化合物治療或保護之鳥可與商業或非商業鳥類飼養有關。此等鳥尤其包括鴨科(諸如，天鵝、鵝及鴨)、鳩鴿科(諸如，斑鳩及家鴿)、雉科(諸如，鷓鴣、松雞及火雞)、Thesienidae(諸如，家雞)及鸚鵡科(諸如，長尾鸚鵡、金剛鸚鵡及經飼養用於寵物或收藏家市場之鸚鵡)。

為達成本發明之目的，術語「魚」應理解為包括(不限於)硬骨魚(Teleosti)群之魚，亦即硬骨魚。鮭形目(Salmoniformes)(其包括鮭科(Salmonidae))與鱸形目(Perciformes)(其包括棘臀魚科(Centrarchidae))兩者均包含在硬骨魚群內。潛在的魚接受者之實例尤其包括鮭科、鮭科(Serranidae)、鯛科(Sparidae)、麗魚科(Cichlidae)及棘臀魚科。

亦涵蓋其他動物受益於本發明之方法，包括有袋動物(諸如，袋鼠)、爬行動物(諸如，農業甲魚)及其他有經濟價值的家畜，對於該等動物而言，本發明之方法安全且有效治療或預防寄生蟲感染或侵染。

藉由向有待保護之動物投與殺寄生蟲有效量之本發明化

合物而控制之無脊椎寄生害蟲的實例包括體外寄生蟲(節肢動物、蟎等)及體內寄生蟲(蠕蟲，例如線蟲、吸蟲、條蟲、棘頭綱蟲等)。

一般描述為蠕蟲病之疾病或疾病群係歸因於動物宿主經稱為蠕蟲之寄生蟲感染。術語「蠕蟲」意欲包括線蟲、吸蟲、條蟲及棘頭綱蟲。蠕蟲病為有關於諸如豬、綿羊、馬、牛、山羊、狗、貓及家禽之馴養動物的普遍且嚴重之經濟問題。

在該等蠕蟲中，描述為線蟲之蠕蟲群引起多種動物廣泛且有時嚴重之感染。預期藉由本發明之化合物及藉由本發明之方法治療之線蟲包括(不限於)以下屬：棘唇線蟲屬(*Acanthocheilonema*)、貓圓屬(*Aelurostrongylus*)、鈎蟲屬(*Ancylostoma*)、管圓線蟲屬(*Angiostrongylus*)、禽蛔屬(*Ascaridia*)、蛔蟲屬(*Ascaris*)、布魯格絲蟲屬(*Brugia*)、仰口屬(*Bunostomum*)、毛細線蟲屬(*Capillaria*)、夏伯特屬(*Chabertia*)、古柏屬(*Cooperia*)、鋸體屬(*Crenosoma*)、網尾線蟲屬(*Dictyocaulus*)、膨結屬(*Diectophyme*)、雙瓣線蟲屬(*Dipetalonema*)、裂頭條蟲屬(*Diphyllobothrium*)、惡絲蟲屬(*Dirofilaria*)、龍線蟲屬(*Dracunculus*)、蟯蟲屬(*Enterobius*)、類絲蟲屬(*Filaroides*)、血矛屬(*Haemonchus*)、異刺屬(*Heterakis*)、兔唇蛔屬(*Lagochilascaris*)、羅阿線蟲屬(*Loa*)、曼森線蟲屬(*Mansonella*)、繆勒屬(*Muellerius*)、板口屬(*Necator*)、細頸屬(*Nematodirus*)、食道口屬(*Oesophagostomum*)、奧思

特線蟲屬 (*Ostertagia*)、尖尾屬 (*Oxyuris*)、副絲蟲屬 (*Parafilaria*)、副蛔屬 (*Parascaris*)、泡翼屬 (*Physaloptera*)、原圓屬 (*Protostrongylus*)、狗尾草屬 (*Setaria*)、尾旋屬 (*Spirocerca*)、冠絲蟲屬 (*Stephanofilaria*)、類圓屬 (*Strongyloides*)、圓線屬 (*Strongylus*)、吸吮屬 (*Thelazia*)、弓蛔屬 (*Toxascaris*)、弓首屬 (*Toxocara*)、旋毛蟲屬 (*Trichinella*)、毛線屬 (*Trichonema*)、毛圓屬 (*Trichostrongylus*)、鞭蟲屬 (*Trichuris*)、彎口屬 (*Uncinaria*) 及吳策線蟲屬 (*Wuchereria*)。

上述各屬中，感染上文提及之動物之最常見線蟲屬為血矛屬、毛圓屬、奧思特線蟲屬、細頸屬、古柏屬、蛔蟲屬、仰口屬、食道口屬、夏伯特屬、鞭蟲屬、圓線屬、毛線屬、網尾線蟲屬、毛細線蟲屬、異刺屬、弓首屬、禽蛔屬、尖尾屬、鈎蟲屬、彎口屬、弓蛔屬及副蛔屬。此等線蟲屬中某些屬(諸如細頸屬、古柏屬及食道口屬)主要侵襲腸道，而諸如血矛屬及奧思特線蟲屬之其他線蟲屬在胃中更為普遍，而諸如網尾線蟲屬之其他線蟲屬則發現於肺中。其他寄生蟲可位於其他組織中，諸如心臟及血管、皮下及淋巴組織及其類似組織中。

預期藉由本發明之化合物及藉由本發明之方法治療的吸蟲包括(不限於)以下屬：翼形屬 (*Alaria*)、片形屬 (*Fasciola*)、微吸蟲屬 (*Nanophyetus*)、後宰屬 (*Opisthorchis*)、並殖屬 (*Paragonimus*) 及裂體屬 (*Schistosoma*)。

預期藉由本發明之化合物及藉由本發明之方法治療的條蟲包括(不限於)以下屬：裂頭條蟲屬、複孔屬(Diplydium)、迭宮屬(Spirometra)及帶屬(Taenia)。

人類胃腸道最常見之寄生蟲屬為鈎蟲屬、板口屬、蛔蟲屬、類圓屬、旋毛蟲屬、毛細線蟲屬、鞭蟲屬及蟯蟲屬。發現於血液或胃腸道外之其他組織及器官中之其他具醫學價值的寄生蟲屬為絲蟲，諸如吳策線蟲屬、布魯格絲蟲屬、蟠尾屬(Onchocerca)及羅阿線蟲屬以及龍線蟲屬及腸外階段之腸內蠕蟲類圓屬及旋毛蟲屬。

許多其他蠕蟲屬及種為此項技術所已知，且亦預期其由本發明之化合物治療。此等蠕蟲非常詳細地列舉於 *Textbook of Veterinary Clinical Parasitology*，第1卷，*Helminths*, E. J. L. Soulsby, F. A. Davis Co., Philadelphia, Pa. ; *Helminths, Arthropods and Protozoa*, (Monnig's *Veterinary Helminthology and Entomology* 之第6版), E. J. L. Soulsby, The Williams and Wilkins Co., Baltimore, Md 中。

亦預期本發明之化合物有效對抗大量動物體外寄生蟲，例如哺乳動物及鳥類之節肢動物體外寄生蟲，不過亦認識到某些節肢動物亦可為體內寄生蟲。

因此，昆蟲及蠕害蟲包括(例如)蟄咬昆蟲，諸如蠅及蚊子、蟎、蜱、虱、跳蚤、椿象、寄生蛆及其類似害蟲。

成年蠅包括(例如)角蠅或擾血蠅(*Haematobia irritans*)、馬蠅或虻屬(*Tabanus spp.*)、廢蠅或廢螫蠅(*Stomoxys calcitrans*)、黑蠅或蚋屬(*Simulium spp.*)、鹿蠅或斑虻屬

(*Chrysops* spp.)、虱蠅或綿羊虱蠅(*Melophagus ovinus*)、采采蠅或舌蠅屬(*Glossina* spp.)。寄生蠅蛆包括(例如)膚蠅(羊鼻蠅(*Oestrus ovis*)及黃蠅屬(*Cuterebra* spp.))、麗蠅或綠蠅屬(*Phaenicia* spp.)、螺旋蛆或對旋麗蠅(*Cochliomyia hominivorax*)、牛皮蠅或皮蠅屬(*Hypoderma* spp.)、羊毛蛆(fleeceworm)及馬胃蠅(*Gastrophilus*)。蚊子包括(例如)庫蚊屬、瘧蚊屬及伊蚊屬。

蟎包括革蟎屬(*Mesostigmata* spp.)，例如革蟎(mesostigmatid)，諸如雞蟎，雞皮刺蟎(*Dermanyssus gallinae*)；疥蟎，諸如疥蟎屬(*Sarcoptidae* spp.)，例如疥蟎(*Sarcoptes scabiei*)；畜癢蟎，諸如癢蟎屬(*Psoroptidae* spp.)，包括牛足蟎(*Chorioptes bovis*)及羊癢蟎(*Psoroptes ovis*)；恙蟎，例如恙蟎屬(*Trombiculidae* spp.)，例如北美恙蟎，阿爾弗雷德恙蟎(*Trombicula alfreddugesi*)。

蜱包括(例如)：軟體蜱，包括軟蜱屬(*Argasidae* spp.)，例如銳緣蜱屬(*Argas* spp.)及鳥蜱屬(*Ornithodoros* spp.)；硬體蜱，包括硬蜱屬(*Ixodidae* spp.)，例如血紅扇頭蜱(*Rhipicephalus sanguineus*)、變異革蜱、安德氏革蜱(*Dermacentor andersoni*)、美洲花蜱、黑腳硬蜱及牛蜱屬(*Boophilus* spp.)。

虱包括(例如)：吸吮虱，例如雞虱屬(*Menopon* spp.)及嗜牛虱屬(*Bovicola* spp.)；咬虱，例如血虱屬(*Haematopinus* spp.)、長顎虱屬(*Linognathus* spp.)及管虱屬(*Solenopotes* spp.)。

跳蚤包括(例如)櫛頭蚤屬(*Ctenocephalides* spp.)，諸如狗蚤(狗櫛頭蚤)及貓蚤(貓櫛頭蚤)；客蚤屬(*Xenopsylla* spp.)，諸如東方鼠蚤(印度客蚤)；及蚤屬(*Pulex* spp.)，諸如人蚤(致癢蚤)。

椿象包括(例如)：臭蟲科或例如普通床蟲(溫帶臭蟲)；錐獵蝽亞科(*Triatominae* spp.)，包括錐鼻蟲(triatomid bug)，其亦稱為接吻蟲；例如長紅錐蝽(*Rhodnius prolixus*)及錐蝽屬(*Triatoma* spp.)。

通常，蠅、跳蚤、虱、蚊子、蚋、蟎、蜱及蠕蟲引起家畜及伴侶動物部門的重大損失。節肢動物寄生蟲亦騷擾人類，且可引導人類及動物體內產生致病性生物體。

許多其他節肢害蟲及體外寄生蟲為此項技術所已知，且亦預期其由本發明之化合物治療。此等害蟲非常詳細地列舉於*Medical and Veterinary Entomology*, D. S. Kettle, John Wiley & Sons, New York及Toronto；*Control of Arthropod Pests of Livestock: A Review of Technology*, R. O. Drummand, J. E. George及S. E. Kunz, CRC Press, Boca Raton, Fla中。

本發明之化合物及組合物亦可有效對抗大量動物原生動物體內寄生蟲，諸如如下表1中所概述之彼等體內寄生蟲。

門	亞門	代表性屬	人類疾病或病症
肉足鞭毛門 (Sarcomastigophora)(具有鞭毛、偽足或兩者)	鞭毛蟲綱 (Mastigophora)(鞭毛)	利什曼原蟲屬 (<i>Leishmania</i>)	內臟、皮膚及黏膜皮膚感染

		錐蟲屬 (Trypanosoma)	昏睡病
			恰加斯氏病 (Chagas' disease)
		賈第鞭毛蟲屬 (Giardia)	腹瀉
		毛滴蟲屬 (Trichomonas)	陰道炎
	肉足綱 (Sarcodina)(偽足)	內阿米巴屬 (Entamoeba)	痢疾、肝膿腫
		雙核阿米巴屬 (Dientamoeba)	結腸炎
		納氏蟲屬 (Naegleria)及棘阿米巴屬 (Acanthamoeba)	中樞神經系統及 角膜潰瘍
		巴貝蟲屬	巴貝蟲病 (Babesiosis)
頂複門 (Apicomplexa)(頂複體)		瘧原蟲屬 (Plasmodium)	瘧疾
		等孢子球蟲屬 (Isospora)	腹瀉
		肉孢子蟲屬 (Sarcocystis)	腹瀉
		隱孢子蟲 (Cryptosporidium)	腹瀉
		弓形蟲屬 (Toxoplasma)	弓形體病
		艾美蟲屬(Eimeria)	雞球蟲病
微孢子蟲門 (Microspora)		腸微孢子蟲屬 (Enterocytozoon)	腹瀉
纖毛亞門 (Ciliophora)(具有纖毛)		腸袋蟲屬 (Balantidium)	痢疾
未分類		肺孢子蟲屬 (Pneumocystis)	肺炎

詳言之，本發明之化合物有效對抗體外寄生蟲，包括跳蚤，諸如貓櫛頭蚤(貓蚤)及狗櫛頭蚤(狗蚤)。

本發明之化合物亦可有效對抗其他體外寄生蟲，包括：蠅，諸如擾血蠅(擾角蠅(*Lyperosia irritans*))(角蠅)、廢螫蠅(廢蠅)、蚋屬(黑蠅)、舌蠅屬(采采蠅)、擾齒股蠅

(*Hydrotaea irritans*)(頭蠅)、秋家蠅(*Musca autumnalis*)(面蠅)、舍蠅(家蠅)、簡蠅(*Morellia simplex*)(汗蠅)、虻屬(馬蠅)、牛皮蠅(*Hypoderma bovis*)、紋皮蠅(*Hypoderma lineatum*)、絲光綠蠅(*Lucilia sericata*)、銅綠蠅(*Lucilia cuprina*)(綠色麗蠅)、麗蠅屬(*Calliphora* spp.)(麗蠅)、原伏蠅屬(*Protophormia* spp.)、羊鼻蠅(鼻部馬蠅)、庫蠓屬(*Culicoides* spp.)(蠓)、馬虱蠅(*Hippobosca equine*)、馬胃蠅(*Gastrophilus instestinalis*)、紅尾胃蠅(*Gastrophilus haemorrhoidalis*)及納斯利胃蠅(*Gastrophilus naslis*)；虱，諸如嗜牛虱(*Bovicola bovis*)(牛毛虱(*Damalinia bovis*))、嗜馬虱(*Bovicola equi*)、驢血虱(*Haematopinus asini*)、貓毛虱(*Felicola subrostratus*)、異袋鼠虱(*Heterodoxus spiniger*)、棘顎虱(*Lignonathus setosus*)及犬鬣毛虱(*Trichodectes canis*)；羊蟬蠅，諸如綿羊虱蠅；蟎，諸如癢蟎屬(*Psoroptes* spp.)、疥蟎(*Sarcoptes scabiei*)、牛足蟎(*Chorioptes bovis*)、馬蠕形蟎(*Demodex equi*)、攪蟎屬(*Cheyletiella* spp.)、貓疥蟎(*Notoedres cati*)、恙蟎屬(*Trombicula* spp.)及耳癢蟎(*Otodectes cyanotis*)(耳蟎)；及蟬，諸如硬蟬屬、牛蟬屬、扇頭蟬屬(*Rhipicephalus* spp.)、花蟬屬(*Amblyomma* spp.)、革蟬屬(*Dermacentor* spp.)、玻眼蟬屬(*Hyalomma* spp.)及血蟬屬(*Haemaphysalis* spp.)。

適用於本發明之組合物之生物學活性化合物或藥劑包括有機磷酸酯農藥。此類農藥具有極廣泛之作為殺昆蟲劑之

活性，且在某些情況下具有極廣泛之驅蟲活性。有機磷酸酯農藥包括(例如)百治磷(dicrotophos)、託福松、大滅松、大利松、二硫松(disulfoton)、三氯松、穀硫磷、毒死蜱、馬拉硫磷、滅多松(oxydemeton-methyl)、甲胺磷、歐殺松、乙基對硫磷、甲基對硫磷、速滅磷、甲拌磷、卡波倍硫磷(carbofenthion)及伏殺磷。亦預期包括本發明之方法及化合物與包括(例如)加保利、加保扶、涕滅威、稻得壯(molinate)、滅多蟲、加保扶等之胺基甲酸酯類型農藥之組合，以及與有機氯類型農藥之組合。進一步預期包括與生物農藥之組合，該等生物農藥包括(例如)驅避劑、除蟲菊酯(及其合成變體，例如丙烯除蟲菊酯(allethrin)、苜呋菊酯(resmethrin)、百滅寧、四溴菊酯)及常用作殺蟎劑之菸鹼。另外涵蓋與雜項農藥之組合，該等農藥包括：蘇雲金芽孢桿菌、殺蟎酯、甲脒(formamidines)(例如，三亞蟎)、銅化合物(例如，氫氧化銅及硫酸氧氯化銅)、賽扶寧、賽滅寧、大克蟎、硫丹、益化利、芬化利、 λ -賽洛寧、甲氧氯及硫。

值得注意的為選自技術已知之驅蟲劑之其他生物學活性化合物或藥劑，諸如阿維菌素(例如，伊維菌素(ivermectin)、莫昔克丁(moxidectin)、美倍黴素(milbemycin)、苯并咪唑(benzimidazole)(例如，阿苯達唑(albendazole)、三氯苯達唑(triclabendazole)、水楊苯胺(salicylanilide)(例如，氯生太爾(closantel)、羥氯紫胺(oxyclozanide)、經取代之酚(例如，硝碘酚腈

(nitroxylnil))、噻啉(例如，噻啉(pyrantel))、咪唑并噻啉(例如，左旋咪唑(levamisole))及吡喹酮(praziquantel)。

適用於本發明組合物之其他生物學活性化合物或藥劑可選自昆蟲生長調節劑(IGR)及保幼激素類似物(JHA)，諸如二福隆、殺蟲隆、氟佐隆(fluzuron)、賽滅淨、美賜年等，從而提供對動物受檢者上以及動物受檢者之環境內的寄生蟲(在昆蟲發育之所有階段，包括卵)之初始及持續控制。

值得注意的為選自驅寄生蟲劑類別阿維菌素化合物的適用於本發明組合物之生物學活性化合物或藥劑。如上所述，阿維菌素家族化合物為一系列已知可用於對抗哺乳動物體內之廣泛譜系之體內寄生蟲及體外寄生蟲的極有效殺寄生蟲劑。

用於本發明之範疇內的重要化合物為伊維菌素。伊維菌素為阿維菌素之半合成衍生物且一般製成至少80%之22,23-二氫阿維菌素B_{1a}與小於20%之22,23-二氫阿維菌素B_{1b}之混合物形式。伊維菌素揭示於U.S. 4,199,569中。

阿巴汀為在U.S. 4,310,519中揭示為阿維菌素B_{1a}/B_{1b}之阿維菌素。阿巴汀含有至少80%之阿維菌素B_{1a}及不超過20%之阿維菌素B_{1b}。

另一重要阿維菌素為多拉克汀(Doramectin)，其亦稱為25-環己基-阿維菌素B₁。多拉克汀之結構及製備揭示於U.S. 5,089,480中。

另一重要阿維菌素為莫昔克丁。莫昔克丁亦稱為LL-

F28249 α 係獲知於U.S. 4,916,154。

另一重要阿維菌素為塞拉菌素(Selamectin)。塞拉菌素為25-環己基-25-脫(1-甲基丙基)-5-脫氧-22,23-二氫-5-(羥基亞胺基)-阿維菌素B₁單糖。

美倍黴素或B41為一種自產生美倍黴素之鏈黴菌(Streptomyces)菌株的發酵肉湯分離之物質。微生物、發酵條件及分離程序更全面地描述於U.S. 3,950,360及U.S. 3,984,564中。

可如U.S. 5,288,710或U.S. 5,399,717中所述製備之因滅汀(4"-脫氧-4"-表-甲胺基阿維菌素B₁)為兩種同系物4"-脫氧-4"-表-甲胺基阿維菌素B_{1a}及4"-脫氧-4"-表-甲胺基阿維菌素B_{1b}之混合物。較佳使用因滅汀鹽。可用於本發明之因滅汀鹽的非限制性實例包括U.S. 5,288,710中所述之鹽，例如衍生自苯甲酸、經取代苯甲酸、苯磺酸、檸檬酸、磷酸、酒石酸、順丁烯二酸及其類似酸之鹽。用於本發明之因滅汀鹽最佳為因滅汀苯甲酸鹽。

依普菌素(Eprinomectin)在化學上稱為4"-表-乙醯胺基-4"-脫氧-阿維菌素B₁。依普菌素係特定研發用於所有牛類及年齡群。其為展示對抗體內寄生蟲及體外寄生蟲之廣譜活性同時亦使得在肉及乳中之殘餘物最少的第一種阿維菌素。其具有在局部傳遞時高度有效之額外益處。

本發明之組合物視情況包含一或多種以下抗寄生蟲化合物之組合：咪唑并[1,2-b]噻嗪化合物，如藉由2004年12月22日申請之美國申請案第11/019,597號所述；1-(4-單及二-

鹵甲基磺醯基苯基)-2-醯基胺基-3-氟丙醇化合物，如藉由2004年12月21日申請之美國申請案第11/018,156號所述；三氟甲烷磺醯基胺基醚衍生物，如2005年9月21日申請之美國申請案第11/231,423號所述；及n-[(苯氧基)苯基]-1,1,1-三氟甲烷磺醯胺及n-[(苯基硫烷基)苯基]-1,1,1-三氟甲烷磺醯胺衍生物，如2005年6月9日申請之美國臨時申請案第60/688,898號所述。

本發明之組合物亦可進一步包含殺吸蟲劑。合適之殺吸蟲劑包括(例如)三氟苯達唑、芬苯達唑(fenbendazole)、阿苯達唑、氯舒隆(clorsulon)及奧苯達唑(oxibendazole)。應瞭解上述組合可進一步包括抗生素、抗寄生蟲及抗吸蟲活性化合物之組合。

除上述組合之外，亦預期提供如本文所述之本發明方法及化合物與諸如微量元素、消炎藥、抗感染藥、激素、皮膚病學製劑(包括殺菌劑及消毒劑)及免疫生物製劑(諸如，疫苗及抗血清)之其他動物健康藥物的組合，以預防疾病。

舉例而言，該等抗感染劑包括一或多種抗生素，其視情況在使用本發明化合物或方法治療期間共投與(例如，以組合之組合物及/或以分開劑型)。適於此目的之技術已知之抗生素包括(例如)下文所列之彼等抗生素。

一種適用抗生素為氟苯尼考(Florfenicol)，亦稱為D-(蘇)-1-(4-甲基磺醯基苯基)-2-二氯乙醯胺基-3-氟-1-丙醇。另一種重要抗生素化合物為D-(蘇)-1-(4-甲基磺醯基苯

基)-2-二氟乙醯胺基-3-氟-1-丙醇。另一適用抗生素為甲硯黴素(Thiamphenicol)。用於製造此等抗生素化合物之方法及可用於該等方法之中間物描述於U.S. 4,311,857、U.S. 4,582,918、U.S. 4,973,750、U.S. 4,876,352、U.S. 5,227,494、U.S. 4,743,700、U.S. 5,567,844、U.S. 5,105,009、U.S. 5,382,673、U.S. 5,352,832及U.S. 5,663,361中。已揭示其他氟苯尼考類似物及/或前藥且該等類似物亦可用於本發明之組合物及方法中(參見例如美國專利申請公開案第2004/0082553號及美國專利申請案第11/016,794號)。

另一適用抗生素化合物為替米考星(tilmicosin)。替米考星為一種大環內酯抗生素，其在化學上定義為20-二氫-20-脫氧-20-(順-3,5-二甲基哌啶-1-基)-脫碳黴糖泰樂菌素(desmycosin)，且據稱揭示於U.S. 4,820,695中。

另一用於本發明之適用抗生素為土拉黴素(tulathromycin)。土拉黴素亦鑑別為(2R,3S,4R,5R,8R,10R,11R,12S,13S,14R) 13-[(2,6-雙脫氧-3-C-甲基-3-O-甲基-4-C-[(丙基胺基)甲基]- α -L-核糖-己吡喃糖基]氧基]-2-乙基-3,4,10-三羥基-3,5,8,10,12,14-六甲基-11-[[3,4,6-三脫氧-3-(二甲基胺基)- β -D-木-己吡喃糖基]氧基]-1-氧雜-6-氮雜環十五-15-酮。土拉黴素可根據美國專利公開案第2003/0064939 A1號中所述之程序製備。

用於本發明之其他抗生素包括頭孢菌素，諸如頭孢噻呋(ceftiofur)、頭孢喹諾(cefquinome)等。本發明之調配物中

頭孢菌素之濃度視情況在約1 mg/mL至500 mg/mL之範圍內。

另一適用抗生素包括氟喹諾酮(fluoroquinolones)，諸如恩諾沙星(enrofloxacin)、達氟沙星(danofloxacin)、雙氟沙星(difloxacin)、奧比沙星(orbifloxacin)及馬波沙星(marbofloxacin)。恩諾沙星通常以約100 mg/mL之濃度投與。達氟沙星通常以約180 mg/mL之濃度投與。

其他適用大環內酯抗生素包括酮內酯類化合物，或更特定言之，氮雜內酯(azalide)類化合物。該等化合物描述於(例如)U.S. 6,514,945、U.S. 6,472,371、U.S. 6,270,768、U.S. 6,437,151、U.S. 6,271,255、U.S. 6,239,112、U.S. 5,958,888、U.S. 6,339,063及U.S. 6,054,434中。

其他適用抗生素包括四環素(tetracycline)，尤其氯四環素(chlortetracycline)及氧四環素(oxytetracycline)。其他抗生素可包括 β -內醯胺，諸如青黴素類(penicillins)，例如青黴素、胺苄西林(ampicillin)、阿莫西林(amoxicillin)或阿莫西林與克拉維酸(clavulanic acid)或其他 β 內醯胺酶抑制劑之組合。

獸醫學部門中之非農藝應用係藉由習知方式，諸如藉由以例如錠劑、膠囊、飲料、澆灌製劑、顆粒、漿液、boli、經由餵食之程序或栓劑之形式腸內投與；或藉由非經腸投與，諸如藉由注射液(包括肌肉內、皮下、靜脈內、腹膜內)或植入物；藉由經鼻投與；藉由局部投與，例如以浸泡或浸漬、噴霧、洗滌、以散劑塗佈或施用於動

物之較小區域之形式，及經由包含本發明之化合物或組合物之物品(諸如頸環、耳標、尾帶、肢帶或韁繩)。

可將任何本發明之化合物或該等化合物之合適組合直接投與動物受檢者及/或藉由將其施用於動物所居住之局部環境(諸如，寢具、圍欄或其類似物)而間接投與。直接投藥包括使受檢動物之皮膚、皮毛或羽毛與該等化合物接觸，或將該等化合物餵食或注射至動物體內。

本發明之化合物可以控制釋放形式，例如以皮下緩釋調配物或以附著於動物之控制釋放裝置(諸如，除蚤項圈)之形式投與。用於農藥之控制釋放以便長期保護伴侶動物免遭跳蚤侵染的套環為此項技術已知，且由(例如)U.S. 3,852,416、U.S. 4,224,901、U.S. 5,555,848及U.S. 5,184,573描述。

通常，本發明之殺寄生蟲組合物包含式1化合物與一或多種醫藥學上或獸醫學上可接受之載劑(包含根據預期投藥途徑(例如，經口、局部或非經腸投與，諸如注射)及根據標準規範而選擇之賦形劑及助劑)的混合物。此外，合適載劑係基於與組合物中之一或多種活性成份之相容性(包括諸如相對於pH值之穩定性及水分含量之因素)來選擇。因此，值得注意的為一種用於保護動物免遭無脊椎寄生害蟲侵襲之組合物，其包含殺寄生蟲有效量之本發明化合物及至少一種載劑。

對於包括靜脈內、肌肉內及皮下注射之非經腸投與而言，本發明之化合物可調配為於油性或水性媒劑中之懸浮

液、溶液或乳液，且可含有諸如懸浮劑、穩定劑及/或分散劑之添加劑。本發明之化合物亦可經調配用於快速注射或連續輸液。用於注射之醫藥組合物包括水溶性形式之活性成份(例如，活性化合物之鹽)較佳於含有醫藥調配技術中已知之其他賦形劑或助劑的生理學相容緩衝劑中之水溶液。此外，可製備活性化合物於親脂性媒劑中之懸浮液。合適親脂性媒劑包括脂肪油(諸如，芝麻油)、合成脂肪酸酯(諸如，油酸乙酯及三酸甘油酯)或諸如脂質體之物質。水性注射懸浮液可含有增加懸浮液黏度之物質，諸如羧甲基纖維素鈉、山梨糖醇或葡聚糖。用於注射之調配物可以單位劑型存在，例如存在安瓿或多劑量容器中。或者，活性成份可呈粉末形式以便在使用前用合適媒劑(例如，無菌無熱原質水)組配。

除上文所述之調配物外，本發明之化合物亦可調配為儲槽式製劑。該等長效調配物可藉由植入(例如，皮下或肌肉內)或藉由肌肉內或皮下注射來投與。本發明之化合物可與合適聚合物或疏水性物質一起調配(例如，與藥理學上可接受之油調配為乳液)、與離子交換樹脂一起調配或調配為微溶衍生物(諸如(但不限於)微溶鹽)用於此投藥途徑。

對於藉由吸入投藥而言，本發明之化合物可使用加壓包裝或噴霧器及適當推進劑(例如(但不限於)二氯二氟甲烷、三氯氟甲烷、二氯四氟乙烷或二氧化碳)以氣霧劑噴霧形式來傳遞。在加壓氣霧劑之狀況下，單位劑量可藉由提供

閥來控制以傳遞經計量之量。可將於吸入器或吹入器中使用之(例如)明膠之膠囊及藥筒調配成含有化合物與合適粉末基質(諸如, 乳糖或澱粉)之粉末混合物。

已發現本發明之化合物具有有利之藥物動力學及藥效學性質, 提供自經口投藥及攝入之系統可用性。因此, 在經有待保護之動物攝入後, 血流中殺寄生蟲有效濃度之本發明化合物保護所治療之動物免遭吸血害蟲(諸如, 跳蚤、蟬及虱)侵襲。因此, 值得注意的為一種用於保護動物免遭無脊椎寄生害蟲侵襲之呈用於經口投藥之形式的組合物(亦即, 除殺寄生蟲有效量之本發明化合物外, 亦包含一或多種選自適於經口投藥之黏合劑及填充劑及飼料濃縮物載劑的載劑)。

對於以溶液(對於吸收最易利用之形式)、乳液、懸浮液、漿液、凝膠、膠囊、錠劑、大丸劑、散劑、顆粒、瘤胃保留物及飼料/水/舔塊(lick blocks)之形式經口投藥而言, 本發明之化合物可與此項技術中已知之適於經口投與組合物的黏合劑/填充劑一起調配, 該等黏合劑/填充劑諸如糖及糖衍生物(例如, 乳糖、蔗糖、甘露糖醇、山梨糖醇)、澱粉(例如, 玉米澱粉、小麥澱粉、米澱粉、馬鈴薯澱粉)、纖維素及衍生物(例如, 甲基纖維素、羧甲基纖維素、乙基羥基纖維素)、蛋白質衍生物(例如, 玉米蛋白、明膠)及合成聚合物(例如, 聚乙烯醇、聚乙烯吡咯啉酮)。必要時, 可添加潤滑劑(例如, 硬脂酸鎂)、崩解劑(例如, 交聯之聚乙烯吡咯啉酮、瓊脂、褐藻酸)及染料或顏料。

漿液及凝膠通常亦含有黏著劑(例如，阿拉伯膠、褐藻酸、膨潤土、纖維素、三仙膠、膠狀矽酸鋁鎂)以幫助保持組合物與口腔接觸且不易噴出。

若殺寄生蟲組合物係呈飼料濃縮物形式，則載劑通常係選自高效能飼料、飼料用穀類或蛋白質濃縮物。除殺寄生蟲活性成份外，該等含有飼料濃縮物之組合物可包含促進動物健康或生長、改良屠宰動物之肉質或以其他方式適用於畜牧業之添加劑。此等添加劑可包括(例如)維生素、抗生素、化學治療劑、抑菌劑、抑真菌劑、球蟲抑制劑及激素。

亦可使用(例如)習知栓劑基質(諸如，可可脂或其他甘油酯)將式1化合物調配於直腸組合物(諸如，栓劑或保留灌腸劑)中。

用於局部投與之調配物通常呈散劑、乳膏、懸浮液、噴霧、乳液、泡沫、漿液、氣霧劑、軟膏、油膏或凝膠之形式。局部調配物更通常為水溶性溶液，其可呈在使用之前稀釋之濃縮物形式。適於局部投與之殺寄生蟲組合物通常包含本發明之化合物及一或多種局部合適之載劑。在將殺寄生蟲組合物局部塗覆於動物外表呈線狀或點狀(亦即，「噴滴(spot-on)」治療)的過程中，活性成份在動物表面上遷移以覆蓋其大部分或所有外表面區域。因此，經治療之動物尤其免遭取食於動物表皮之無脊椎害蟲(諸如，蟬、跳蚤及虱)侵襲。因此，用於局部定位投與之調配物通常包含至少一種便於活性成份在皮上遷移及/或滲入動物表

皮中之有機溶劑。該等調配物中之載劑包括：丙二醇、石蠟、芳族化合物、酯(諸如，十四烷酸異丙酯)、乙二醇醚、醇類(諸如，乙醇、正丙醇、2-辛基十二烷醇或油醇)；於單羧酸酯中之溶液，諸如十四烷酸異丙酯、棕櫚酸異丙酯、十二烷酸草酸酯、油酸油烯酯、油酸癸酯、月桂酸己酯、油酸油烯酯、油酸癸酯、鏈長為 $C_{12}-C_{18}$ 之飽和脂肪醇之己酸酯；二羧酸酯溶液，諸如鄰苯二甲酸二丁酯、間苯二甲酸二異丙酯、己二酸二異丙酯、己二酸二正丁酯或脂肪酸酯溶液，例如二醇。亦存在獲知於醫藥或美容業之結晶抑制劑或分散劑可為有利的。

亦可製備澆潑調配物以控制具有農業價值之動物中的寄生蟲。本發明之澆潑調配物可呈液體、散劑、乳液、泡沫、漿液、氣霧劑、軟膏、油膏或凝膠之形式。澆潑調配物通常為液體。此等澆潑調配物可有效施用於綿羊、牛、山羊、其他反芻動物、駱駝、豬及馬。澆潑調配物通常藉由在動物之背部中線(背部)或肩膀上以一或數條線或以點傾倒來施用。調配物更通常藉由沿動物背部、沿脊柱傾倒來施用。調配物亦可藉由其他習知方法施用於動物，該等使用方法包括將浸透之材料在動物之至少較小區域上擦拭，或使用市售施用器、藉助於注射器、藉由噴霧或藉由使用噴霧管道(spray race)來將其施用。澆潑調配物包括載劑且亦可包括一或多種其他成份。合適其他成份之實例為穩定劑(諸如，抗氧化劑)、分散劑、防腐劑、黏著促進劑、活性增溶劑(諸如，油酸)、黏度改質劑、UV阻斷劑或

吸收劑及著色劑。包括陰離子型、陽離子型、非離子型及兩性表面活性劑之表面活性劑亦可包括在此等調配物中。

本發明之調配物通常包括抗氧化劑，諸如BHT(丁基化羥基甲苯)。抗氧化劑一般以0.1-5%(重量/體積)之量存在。一些調配物需要增溶劑，諸如油酸，以使活性劑溶解(尤其若使用賜諾殺)。用於此等澆潑調配物中之常用分散劑為：IPM、IPP、飽和C₁₂-C₁₈脂肪醇之辛酸/癸酸酯、油酸、油烯酯、油酸乙酯、三酸甘油酯、矽油及DPM。本發明之澆潑調配物係根據已知技術製備。在澆潑調配物為溶液之狀況下，需要時使用熱及攪拌，將殺寄生蟲劑/殺昆蟲劑與載劑或媒劑混合。助劑或其他成份可添加至活性劑與載劑之混合物中，或其可在載劑添加之前與活性劑混合。若澆潑調配物為乳液或懸浮液，則此等調配物類似地使用已知之技術製備。

可採用針對相對疏水性之醫藥化合物之其他傳遞系統。脂質體及乳液為疏水性藥物之傳遞媒劑或載劑之熟知實例。此外，若需要，則可使用諸如二甲亞砷之有機溶劑。

對於農藝應用而言，達成有效控制所需之施用率(亦即「生物學有效量」)將視諸如有待控制之無脊椎動物之物種、害蟲之生命週期、生命階段、其尺寸、地點、季節、宿主作物或動物、攝食行為、交配行為、周圍濕度、溫度及其類似物的因素而定。在正常情況下，每公頃約0.01 kg至2 kg之活性成份之施用率足以控制農藝生態系統中之害蟲，但少至0.0001公斤/公頃可為足夠的或可能需要多至8

公斤/公頃。對於非農藝應用而言，有效施用率將在約1.0毫克/平方公尺至50毫克/平方公尺之範圍內，但少至0.1毫克/平方公尺可為足夠的或可能需要多至150毫克/平方公尺。熟習此項技術者可易於確定達成所要無脊椎害蟲控制程度所需要之生物學有效量。

一般對於獸醫學用途而言，向動物投與殺寄生蟲有效量之式I化合物以使其免遭無脊椎寄生害蟲侵襲。殺寄生蟲有效量為達到可觀測之減少目標無脊椎寄生害蟲之出現或活性的作用所需之活性成份之量。熟習此項技術者將瞭解殺寄生蟲有效劑量可隨本發明之各種化合物及組合物、所需殺寄生蟲作用及持續時間、目標無脊椎害蟲物種、有待保護之動物、施用模式及其類似物而變化，且達到特定結果所需之量可經由簡單實驗來確定。

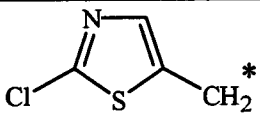
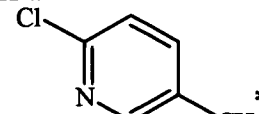
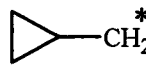
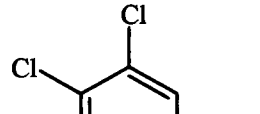
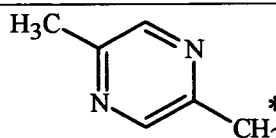
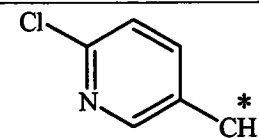
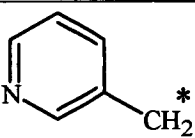
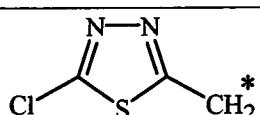
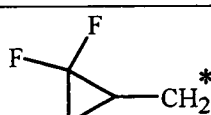
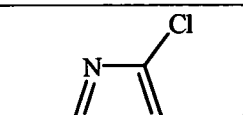
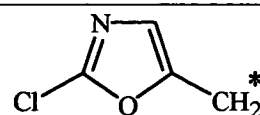
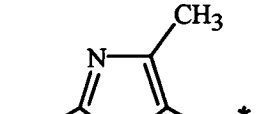
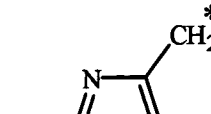
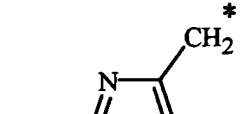
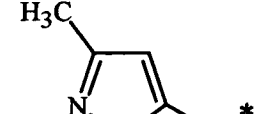
對於向恆溫動物經口投與而言，本發明化合物之日劑量通常在每公斤動物體重約0.01 mg至約100 mg之範圍內，更通常在每公斤動物體重約0.5 mg至約100 mg之範圍內。對於局部(例如，經皮)投與而言，浸液及噴霧通常含有約0.5 ppm至約5000 ppm、更通常約1 ppm至約3000 ppm之本發明化合物。

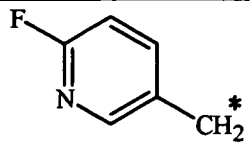
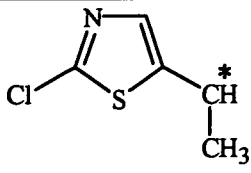
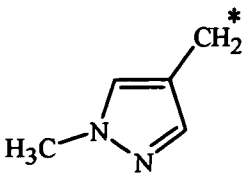
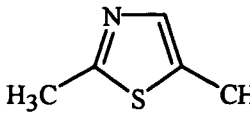
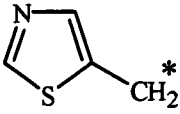
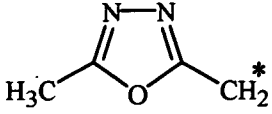
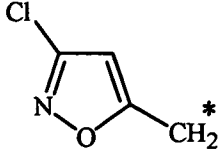
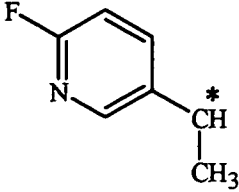
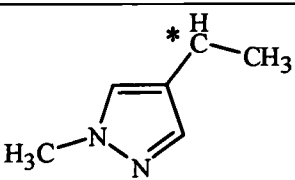
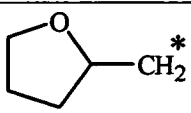
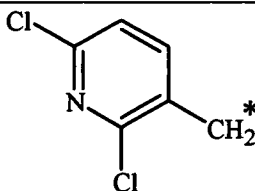
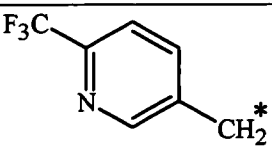
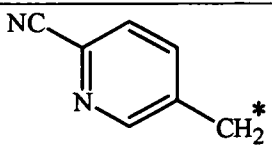
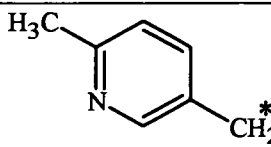
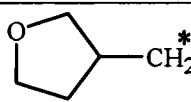
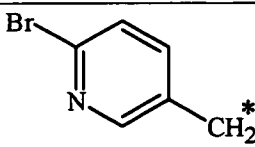
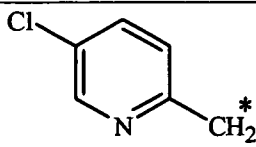
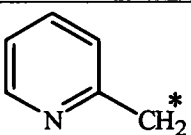
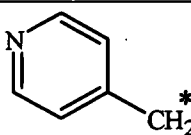
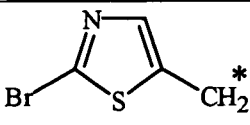
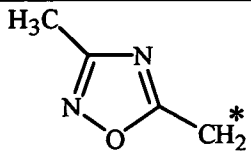
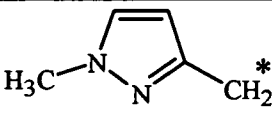
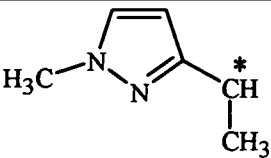
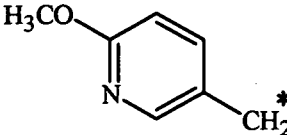
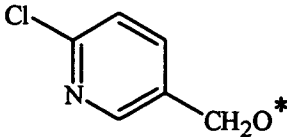
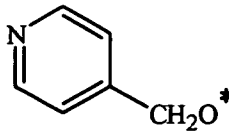
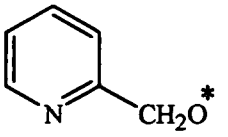
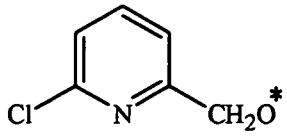
藉由本文所述之方法製備的本發明之化合物展示於索引表A-F中。關於 ^1H NMR數據參見索引表G。對於質譜數據($\text{AP}^+(\text{M}+1)$)而言，所報導之數值為藉由添加 H^+ (分子量為1)至分子(M)中以產生藉由質譜分析使用大氣壓力化學電離(AP^+)觀測到之M+1峰而形成的母分子離子之分子量。未報

導在含有多個鹵素之化合物的情況下出現之替代分子離子峰(例如, $M+2$ 或 $M+4$)。縮寫「Ex.」代表「實例」且後面有指示製備該化合物之合成實例的數字。索引表C中之變數「 R^a 」表示如索引表C中所列之取代基之一或其組合。

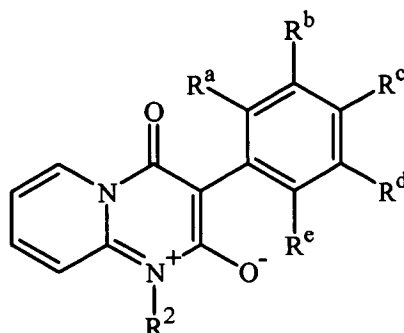
以下其他縮寫用於索引表中, 如下: Cmpd 意謂化合物, Me 為甲基, Et 為乙基, i-Pr 異丙基, n-Bu 為正丁基, t-Bu 為第三丁基, Ph 為苯基, CHO 為甲醯基, Ac 為乙醯基(亦即, $C(O)CH_3$)且 SO_2Me 為甲基磺醯基。

下文所示之片段 A-1 至 A-42 及 B-1 至 B-4 在索引表中提及。星號*表示片段至分子其餘部分之連接點。

			
A-1	A-2	A-3	A-4
			$ClCF_2CHFCH_2CH_2^*$
A-5	A-6	A-7	A-8
			
A-9	A-10	A-11	A-12
			
A-13	A-14	A-15	A-16

			
A-17	A-18	A-19	A-20
			
A-21	A-22	A-23	A-24
	$\text{ClCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2^*$		
A-25	A-26	A-27	A-28
			
A-29	A-30	A-31	A-32
			
A-33	A-34	A-35	A-36
			
A-37	A-38	A-39	A-40
			
A-41			
			
B-1	B-2	B-3	B-4

索引表 A



化合物	R ²	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
1	CH ₂ CF ₃	H	Br	H	H	H	233- 234	
2	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₃	H	H	H	124- 125	
3	CH ₂ CF ₃	H	Cl	H	H	H	*	
5	CH ₂ CF ₃	H	H	F	H	H	205- 206	
6	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	H	H	178- 179	
7	CH ₂ CF ₃	H	H	H	H	H	**	
8	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	OCF ₃	H	H	H	*	
9	CH ₂ CF ₃	Cl	Cl	H	H	H	*	
10	CH ₂ CF ₃	F	H	F	H	H	*	
11	CH ₂ CF ₃	F	H	H	H	H	211- 212	
12	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	H	H	H	*	
13	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	H	H	H	162- 163	
14	CH ₂ CF ₃	F	H	H	OCF ₃	H	*	
15	CH ₂ CF ₃	H	Cl	H	Cl	H	*	
16	CH ₂ CF ₃	H	CH ₃	F	H	H	239- 240	
17	CH ₂ CF ₃	OCH ₃	H	H	H	H	*	
18	A-3	H	OCF ₃	H	H	H	*	
19	A-3	H	H	F	H	H	188- 189	
20	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	F	H	F	H	*	
21	CH ₂ CF ₃	F	H	Cl	H	H	*	
22	A-8	H	OCF ₃	H	H	H	*	
23	CH ₂ CF ₃	H	F	F	H	H	118- 119	
24	CH ₂ CF ₃	H	Br	F	H	H	213- 214	
25	CH ₂ CF ₃	OCH ₃	H	H	Cl	H	*	

化合物	R ²	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	mp(°C)	AP+ (M+1)
26	CH ₂ CF ₃	H	H	Cl	H	H	226- 227	
27	A-8	H	H	F	H	H	*	
28	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	H	H	*	
29	A-3	Cl	H	F	H	H	191- 192	
30	A-8	F	H	F	H	H	*	
31	A-3	F	H	F	H	H	204- 205	
32	CH ₂ CF ₃	H	F	H	F	H	*	
33	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H	OCF ₃	H	H	H	*	
34	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H	H	H	H	H	*	
35	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H	H	F	H	H	*	
36	CH ₂ CF ₂ CF ₃	F	H	F	H	H	*	
37	CH ₂ CF=CF ₂	H	H	H	H	H	*	
38	CH ₂ CH ₂ CF ₃	H	H	H	H	H	*	
39	A-3	H	H	H	H	H	*	
40	CH ₂ CF ₃	H	OCF ₃	H	H	H	140- 141	
41	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	氟基	H	H	*	
122	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H	H	**	
42	A-1	H	H	F	H	H	*	
43	A-1	H	H	H	H	H	233- 235	
44	A-1	F	H	F	H	H	*	
45	A-1	H	OCF ₃	H	H	H	123- 125	
46	A-1	H	CF ₃	H	H	H	152- 153	
47	A-1	H	Cl	H	H	H	235- 237	
48	A-1	H	H	OCHF ₂	H	H	182- 183	
49	A-1	H	H	OCH ₃	H	H	215- 217	
50	A-1	F	H	H	H	H	*	
51	A-2	H	Br	H	H	H	*	
52	A-2	H	Cl	H	CF ₃	H	*	
53	A-2	H	CF ₃	H	H	H	*	
54	A-2	H	OCF ₃	H	H	H	*	
55	A-2	H	Br	H	OCF ₃	H	*	
56	A-2	H	Cl	H	H	H	*	
57	A-2	H	H	F	H	H	*	
58	A-2	F	H	H	OCF ₃	H	**	
59	A-2	H	H	H	H	H	**	
60	A-2	H	H	OCHF ₂	H	H	*	
61	A-2	H	F	H	H	H	*	
62	A-2	F	H	H	Br	H	*	
63	A-2	F	H	F	H	H	*	

化合物	R ²	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	mp.(°C)	AP+ (M+1)
64	A-2	Cl	H	F	H	H	*	
65	A-2	H	H	F	H	H	211- 213	
66	A-2	F	H	H	CF ₃	H	*	
67	A-2	Cl	H	H	OCF ₃	H	*	
68	A-2	F	CF ₃	H	H	H	*	
70	A-2	F	H	H	Cl	H	*	
71	A-2	F	H	F	H	H	226- 228	
72	A-2	F	H	H	H	H	*	
73	A-2	H	H	OCF ₃	H	H	*	
74	A-2	H	CF ₃	F	H	H	*	
75	A-2	H	H	OCH ₃	H	H	*	
76	A-2	H	H	CF ₃	H	H	*	
77	A-2	Cl	H	Cl	H	H	*	
78	A-2	F	H	F	F	H	*	
79	A-2	F	H	CF ₃	H	H	*	
80	A-2	F	F	F	H	H	*	
81	A-2	H	H	H	H	H	241- 243	
82	A-2	H	F	F	H	H	*	
83	A-2	H	OCH ₃	H	H	H	*	
84	A-2	H	H	CH ₃	H	H	*	
85	A-2	F	H	Br	H	H	*	
86	A-2	H	CH ₂ CH ₂ O		H	H	*	
87	A-4	H	H	F	H	H	*	
88	A-2	F	H	H	F	H	*	
89	A-2	F	F	H	H	H	*	
90	A-2	CH ₃	H	氟基	H	H	*	
91	A-2	CH ₃	H	Br	H	H	*	
92	A-2	H	Br	F	H	H	*	
93	A-2	H	Br	H	CF ₃	H	*	
94	A-2	F	H	氟基	H	H	*	
95	A-2	F	H	OCH ₃	H	H	*	
96	A-2	CH ₃	H	F	H	H	*	
97	A-5	H	OCF ₃	H	H	H	*	
98	A-2	H	OCH ₂ O		H	H	*	
99	A-2	Br	H	F	H	H	*	
100	A-4	H	H	H	H	H	*	
101	A-2	H	OCH ₃	F	H	H	*	
102	A-2	H	F	OCH ₃	H	H	*	
103	A-7	H	Br	H	OCF ₃	H	*	
104	A-2	H	H	Br	H	H	*	
105	A-2	H	H	氟基	H	H	*	
106	A-2	H	H	Cl	H	H	*	
107	A-2	H	氟基	H	H	H	*	
123	A-1	H	OCH ₃	H	H	H	184- 186	

化合物	R ²	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	mp(°C)	AP+ (M+1)
124	A-1	H	Br	H	H	H	224- 226	
109	A-6	H	H	F	H	H	*	
108	A-2	F	H	F	H	F	*	
161	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	Br	H	H	H		359
162	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	H	H	H		317
163	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	H	F	H	H		317
164	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	<i>i</i> -Pr	H	H		323
165	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	Ph	H	H		357
166	A-1	F	H	H	CF ₃	H		456
167	A-2	F	H	H	CF ₃	H		434
168	A-1	F	H	H	H	F		406
169	A-1	H	Cl	H	Cl	H		438
170	A-9	H	H	H	H	H	208- 210	
171	A-3	F	H	氨基	H	H	*	
172	A-10	F	H	F	H	H		365
173	A-1	F	H	H	Cl	H		422
174	A-11	H	H	H	H	H		404
175	A-11	H	H	F	H	H		422
176	A-11	F	H	F	H	H		440
177	A-11	H	CF ₃	H	H	H		472
178	A-12	H	H	H	H	H		354
179	A-1	H	OCH ₃	H	Br	H		478
180	A-1	H	OCH ₃	H	H	F		418
181	A-13	H	H	H	H	H		384
182	A-13	H	H	F	H	H		402
183	A-13	F	H	F	H	H		420
184	A-13	H	CF ₃	H	H	H		452
185	A-1	H	OCH ₃	H	OCH ₃	H		430
186	A-1	H	CF ₃	H	CF ₃	H		506
187	A-3	H	CF ₃	H	CF ₃	H		429
188	A-3	H	CF ₃	H	Br	H		439
189	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	Br	H	189- 190	
190	A-14	H	H	H	H	H		354
191	A-14	H	H	F	H	H		372
192	A-1	F	OCH ₃	H	H	H		418
193	A-1	H	OCF ₃	H	H	F		472
194	A-15	H	H	H	H	H		370
195	A-15	H	H	F	H	H		388
196	A-16	H	H	H	H	H		334
197	A-16	H	H	F	H	H	175- 177	
198	A-2	H	OCH ₃	H	OCH ₃	H		424
199	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₃	H	OCH ₃	H		381
200	A-1	OCH ₃	H	H	H	H		400
201	A-1	OCH ₃	H	OCH ₃	H	H		430
202	A-17	H	OCH ₃	H	OCH ₃	H		408

化合物	R ²	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	mp.(°C)	AP+ (M+1)
203	A-17	H	CF ₃	H	H	H		416
204	A-17	F	H	F	F	H	215- 217	
205	CH ₂ CF=CH ₂	H	H	F	H	H		315
206	CH ₂ CF=CH ₂	H	OCF ₃	H	H	H		381
207	A-17	H	H	氟基	H	H		373
208	A-17	H	OCH ₃	H	H	H		378
209	CH ₂ CF ₃	F	OCH ₃	H	H	H	*	
210	A-2	F	OCH ₃	H	H	H		412
211	A-18	H	H	H	H	H		384
212	A-18	H	H	F	H	H		402
213	A-19	H	H	H	H	H		333
214	A-19	H	H	F	H	H	210- 211	
215	A-1	H	CF ₃	H	F	H		456
216	CH(CH ₃)CF ₃	H	H	F	H	H		353
217	CH(CH ₃)CF ₃	H	OCF ₃	H	H	H		419
218	A-20	H	H	H	H	H		350
219	A-20	H	H	F	H	H		368
220	A-21	H	H	H	H	H		336
221	A-21	H	H	F	H	H		354
222	CH(CH ₃)CF ₃	F	H	F	H	H		371
223	CH ₂ CF ₃	F	H	氟基	H	H		364
224	A-16	F	H	H	H	H		352
225	A-17	F	H	H	H	H		366
226	A-17	H	OCF ₃	H	H	H		432
227	CH ₂ CHFCl	H	H	F	H	H		387
228	CH ₂ CHFCl	F	H	F	H	H		405
229	A-18	F	H	H	H	H	*	
230	A-19	H	H	氟基	H	H		358
231	A-19	F	H	F	H	H		369
232	A-19	H	OCF ₃	H	H	H		417
233	A-19	F	H	H	H	H		431
234	A-19	OCH ₃	H	H	H	H		363
235	A-2	OCH ₃	H	H	Br	H		474
236	A-2	Cl	H	H	CF ₃	H		466
237	CH(CH ₃)CF ₃	F	H	H	H	H		353
238	A-19	F	H	H	CF ₃	H		419
239	A-19	F	H	氟基	H	H		376
240	CH(CH ₃)CF ₃	H	Br	H	H	H		353
241	A-22	H	H	H	H	H		335
242	CH(CH ₃)CF ₃	H	Br	H	CF ₃	H		481
243	CH(CH ₃)CF ₃	H	OCH ₃	H	H	H		365
244	CH(CH ₃)CF ₃	OCH ₃	H	H	H	H		365
245	A-1	H	SF ₅	H	H	Cl		530
246	A-2	OCH ₃	H	H	CF ₃	H		549
247	A-2	OCH ₃	H	H	Cl	H		428
248	A-23	H	OCF ₃	H	H	H		438
249	A-17	OCH ₃	H	H	H	H		378

化合物	R ²	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	mp.(°C)	AP+ (M+1)
250	A-2	CH ₃	H	CH ₃	H	CH ₃		406
251	A-1	CH ₃	H	CH ₃	H	CH ₃		412
252	CH(CH ₃)CF ₃	Cl	H	H	OCF ₃	H		453
253	CH(CH ₃)CF ₃	H	Br	H	OCF ₃	H		497
254	A-2	H	SF ₅	H	H	H		490
255	CH ₂ CF ₃	H	SF ₅	H	H	H		447
256	A-19	H	Br	H	OCF ₃	H		495
257	A-24	F	H	H	H	H		380
258	A-24	OCH ₃	H	H	H	H		392
259	A-24	H	OCF ₃	H	H	H		446
260	A-24	F	H	F	H	H		398
261	A-6	H	Br	H	CF ₃	H		524
262	A-6	OCH ₃	H	H	H	H		
263	A-1	H	SF ₅	H	H	H		497
264	A-17	Cl	H	H	OCF ₃	H		466
265	A-25	H	H	H	H	H	181- 183	
266	A-17	F	CF ₃	H	H	H		434
267	A-25	H	OCF ₃	H	H	H		431
268	A-17	OCF ₃	H	H	H	H		432
269	A-17	CF ₃	H	H	H	H		416
270	A-1	OCF ₃	H	H	H	H		454
271	A-1	CF ₃	H	H	H	H		438
272	A-6	H	OCF ₃	H	H	H		462
273	A-6	F	H	H	H	H		396
274	A-1	I	H	H	H	H		496
275	A-1	H	I	H	H	H		496
276	A-1	H	Br	OCH ₃	H	H		478
277	A-1	OCH ₃	H	H	Br	H		478
278	CH ₂ CH ₃	H	H	H	H	H		267
279	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	H	H		295
280	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	H	H	H	H		299
281	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	F	H	H		299
282	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	氟基	H	H	H		306
283	CH ₂ CH ₂ CH ₃	氟基	H	H	H	H		306
284	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	F	H	H	H		299
285	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	H	H	H		295
286	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	CH ₃	H	H		295
287	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	H	CF ₃	H		417
288	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	CF ₃	H	H		349
289	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CH ₃	H	H	H		295
290	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	H	H		295
291	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	H	H	H		297
292	CH ₂ CH ₂ CH ₃	OCH ₃	H	H	H	H		311
293	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	OCH ₃	H	H		311
294	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	Cl	H	H		315
295	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃	H	H	H		311
296	CH ₂ CO ₂ Et	H	H	H	H	H		325
297	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	H	H		281

化合物	R ²	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
298	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	F	F	F	H		335
299	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	H	H	H		309
300	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	硝基	H	H	H		326
301	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	Cl	H	H	H		315
302	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	OCF ₃	H	H		365
303	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	NHAc	H	H	H		338
304	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	H	H	H	H		311
305	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CHO	H	H	H		309
306	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	Ac	H	H	H		323
307	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CO ₂ Et	H	H	H		353
308	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	H	H	H	**	349
309	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	H	H	F	H		317
310	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	Cl	H	Cl	H		349
311	CH ₂ CF ₃	H	H	CF ₃	H	H		389
312	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₃	H		457
313	CH ₂ CF ₃	H	F	H	F	H		357
314	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	H	H	Br	H		377
315	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃	H	Br	H		389
316	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	H	H		341
317	CH ₂ CH ₂ CH ₃	OCH ₃	H	H	F	H		329
318	CH ₂ CH ₂ CH ₃	OCH ₃	H	H	Cl	H		345
319	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	CH ₃	H	Cl	H		347
320	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₃	H	Br	H		429
321	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	H	H		389
322	CH ₂ CH ₂ CH ₃	OCF ₃	H	H	H	H		365
323	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	H	H	H	H		405
324	CH ₂ CF ₃	H	H	OCF ₃	H	H		405
325	CH ₂ CF ₃	H	H	氟基	H	H		346
326	CH ₂ CH ₂ CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H	H	H		341
327	A-8	H	H	H	H	H		383
328	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	H	H		381
329	CH ₂ CF ₃	F	CH ₃	H	Cl	H		387
330	CH ₂ CF ₃	F	F	H	H	H		357
331	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	SCH ₃	H	H		327
332	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃	Cl	H	F		363
333	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	<i>t</i> -Bu	H	H		337
334	CH ₂ CH ₂ CH ₃	NHCO <i>t</i> -Bu	H	H	CH ₃	H		394
335	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	SO ₂ Me	H	H		359
336	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₃	Cl	H	F		403
337	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	OCH ₃	H	H		379
338	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	OCH ₃	H	H		419
339	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	<i>n</i> -Bu	H	H	H		337
340	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	H	CF ₃	H	H		367
341	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	OCF ₃	H	H	F		383
342	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	CO ₂ Et	H	H		353
343	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	H		309
344	CH ₂ CH ₂ CH ₃	OCH ₃	H	H	CF ₃	H		379
345	CH ₂ CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	H	H	CF ₃	H	*	
346	CH ₂ CF ₃	OCH ₂ CH ₃	H	H	CF ₃	H	*	

化合物	R ²	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	mp(°C)	AP+ (M+1)
347	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	CF ₃	H	H	H		367
348	CH ₂ CH ₂ CH ₃	OCH ₃	Br	H	CH ₃	H	*	
349	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₃	H	*	
350	CH ₂ CF ₃	F	CF ₃	H	H	H		407
351	A-8	H	H	氟基	H	H	*	
352	CH ₂ CF ₃	F	H	H	F	H	*	
353	CH ₂ CF ₃	H	Cl	F	H	H		373
354	CH ₂ CF ₃	H	H	<i>n</i> -Bu	H	H		377
355	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	F	H	H		407
356	CH ₂ CF ₃	H	F	氟基	H	H		338
357	CH ₂ CF ₃	Cl	H	F	H	H		373
358	CH ₂ CF ₃	OCH ₃	H	F	H	H		368
359	CH ₂ CF ₃	OCH ₃	H	H	CF ₃	H		419
360	CH ₂ CF ₃	H	F	H	H	H		339
361	CH ₂ CF ₃	H	H	CH ₃	H	H		335
362	CH ₂ CF ₃	H	H	OCH ₃	H	H		351
363	CH ₂ CF ₃	H	CH ₃	H	H	H		335
364	CH ₂ CF ₃	H	H	Br	H	H		399
365	CH ₂ CH ₂ CF ₃	H	H	F	H	H		353
366	CH ₂ CH ₂ CF=CF ₂	H	H	F	H	H		365
367	CH ₂ CH ₂ CF=CF ₂	H	OCF ₃	H	H	H		431
368	CH ₂ CH ₂ CF=CF ₂	F	H	F	H	H		383
369	CH ₂ CF ₃	H	氟基	F	H	H	*	
370	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	H	H		439
371	CH ₂ CH ₂ CF=CF ₂	H	CF ₃	H	H	H		415
372	A-8	H	CF ₃	H	H	H		451
373	CH ₂ CH ₂ CF=CF ₂	Cl	H	Cl	H	H		415
374	A-8	Cl	H	Cl	H	H		451
375	CH ₂ CF ₂ CF ₃	Cl	H	Cl	H	H		439
376	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H	H	H	H		335
377	CH ₂ CF ₃	Br	H	H	H	H		399
378	CH ₂ CF ₃	Cl	H	H	H	H		355
379	CH ₂ CF ₃	H	<i>n</i> -Bu	I	H	H		503
380	CH ₂ CF ₃	H	<i>n</i> -Bu	H	H	H		377
381	CH ₂ CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl		423
382	CH ₂ CH ₂ CF=CF ₂	Cl	H	Cl	H	Cl		449
383	A-8	Cl	H	Cl	H	Cl		485
384	CH ₂ CF ₃	Cl	H	H	H	Cl		389
385	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	H		349
386	CH ₂ CF ₃	H	氟基	H	H	H		346
387	CH ₂ CF ₃	<i>n</i> -Bu	H	H	H	H		377
388	CH ₂ CF ₂ CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl		473
389	A-26	H	H	F	H	H		383
390	A-26	F	H	F	H	H		401
391	A-26	H	OCF ₃	H	H	H		449
392	CH ₂ CF ₃	F	F	F	H	H		375
393	CH ₂ CF ₃	F	H	F	F	H		375
394	CH ₂ CF ₃	F	H	F	H	F		375
395	CH ₂ CF ₃	H	F	F	F	H		375

化合物	R ²	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	mp.(°C)	AP+ (M+1)
396	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	F	H	H		407
397	CH ₂ CF ₃	H	OCF ₃	H	H	Cl		439
398	CH ₂ CF ₃	H	CHO	F	H	H		367
399	CH ₂ CF ₃	氟基	H	H	H	H		346
400	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	Br	F	H	H		377
401	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	F	H	H		367
402	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	H	F	H	H		329
403	CH ₂ CF ₃	F	H	Br	H	H		417
404	CH ₂ CF ₃	F	H	F	H	Br		435
405	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	F	F	H	H		317
406	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	Cl	F	H	H		333
407	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	H	F	H	H		333
408	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	H	F	H	H		317
409	CH ₂ CH ₂ CH ₃	OCH ₃	H	F	H	H		329
410	A-8	H	氟基	F	H	H		426
411	A-7	H	OCF ₃	H	H	H		414
412	A-7	H	H	F	H	H		348
413	A-7	F	H	F	H	H		365
414	A-7	H	H	H	H	H		330
415	A-2	CF ₃	H	F	H	H		450
416	A-34	H	H	H	H	H	*	
417	A-2	H	H	SCH ₃	H	H		410
418	A-2	H	Cl	H	Cl	H	*	
419	A-2	Cl	H	F	H	H		398
420	A-2	CH ₃	H	H	H	H		378
421	A-2	OCF ₃	H	H	H	H		448
422	A-2	氟基	H	H	H	H		389
423	A-2	OCH ₃	H	H	H	H		394
424	A-3	H	OCH ₃	H	H	H		323
425	A-2	H	SCH ₃	H	H	H	*	
426	CH ₂ CF ₃	H	硝基	H	H	H	*	
427	A-2	H	Si(CH ₃) ₃	H	H	H	*	
428	A-27	H	H	H	H	H		323
429	A-27	F	H	F	H	H		359
430	A-2	H	H	Si(CH ₃) ₃	H	H	*	
431	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₂ O	H	H	H		365
432	CH ₂ CF ₃	H	OH	H	H	H		337
433	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H	F	H	H	*	
434	CH ₂ CF ₃	H	OAc	H	H	H		379
435	CH ₂ CF ₃	H	CH ₂ CH ₂ O	H	H	H		363
436	A-4	H	OCF ₃	H	H	H	*	
437	A-4	F	H	F	H	H		434
438	CH ₂ CF ₃	H	OCF ₂ O	H	H	H		401
439	A-27	H	H	F	H	H		341
440	A-2	H	CF ₃	H	CF ₃	H		500
441	A-2	H	硝基	H	H	H		409
442	A-2	OCH ₃	H	OCH ₃	H	H		424
443	A-4	H	H	OCH ₃	H	H	*	
444	A-4	F	H	H	H	H		416

化合物	R ²	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
445	A-2	H	CF ₃	OCH ₃	H	H		462
446	A-2	H		OCF ₂ O	H	H		444
447	A-2	H	OAc	H	H	H		422
448	A-2	F	F	OCH ₃	H	H		430
449	A-5	H	H	F	H	H		363
450	A-5	H	H	H	H	H		345
451	A-28	H	H	F	H	H		416
452	A-29	H	H	H	H	H		398
453	A-28	H	OCF ₃	H	H	H	*	
454	A-29	H	H	F	H	H		416
455	A-29	F	H	F	H	H		434
456	A-30	H	H	H	H	H		355
457	A-30	H	H	F	H	H		373
458	A-30	F	H	F	H	H		391
459	A-2	H	OCH ₂ CF ₃	H	H	H	*	
460	A-6	H	H	H	H	H		
461	A-2	F	H	H	H	F		400
462	A-17	F	H	氟基	H	H		391
463	A-31	H	H	H	H	H		344
464	A-31	H	H	F	H	H		362
465	A-31	F	H	F	H	H		380
466	A-32	H	H	H	H	H		323
467	A-32	H	H	F	H	H		341
468	A-32	F	H	F	H	H		359
469	A-1	F	H	氟基	H	H		413
470	A-33	H	H	H	H	H		408
471	A-33	H	H	F	H	H		426
472	A-33	F	H	F	H	H		444
473	A-1	H	CF ₃	F	H	H		455
474	A-1	Cl	H	F	H	H		422
475	A-1	H	H	氟基	H	H		395
476	A-2	H	F	H	F	H		400
477	A-1	H	F	H	H	H		388
478	A-1	H	H	CF ₃	H	H		438
479	A-1	H	H	OCF ₃	H	H		454
480	A-1	H	H	CH ₃	H	H		384
481	A-1	氟基	H	H	H	H		395
482	A-1	H	F	F	H	H		406
483	A-10	H	H	F	H	H	*	
484	A-10	H	OCF ₃	H	H	H		413
485	A-10	H	H	H	H	H		329
486	A-1	H	OCH ₃	F	H	H	*	
487	A-1	Br	H	F	H	H		466
488	A-1	CH ₃	H	氟基	H	H		409
489	A-1	Cl	H	Cl	H	H		438
490	A-1	H	OCF ₃	H	H	Cl		488
491	A-1	H	OCF ₃	H	Br	H	209- 210	

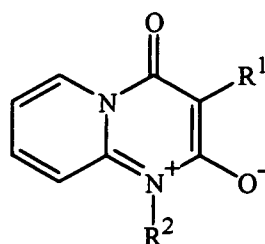
化合物	R ²	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	mp.(°C)	AP+ (M+1)
492	A-1	F	F	F	H	H	196- 198	424
493	A-1	F	H	F	F	H	195- 197	424
494	A-1	H	OCH ₂ O		H	H	>250	414
495	A-1	H	CH ₂ CH ₂ O		H	H	188- 190	412
496	A-1	F	H	H	Br	H		466
497	A-6	F	H	F	H	H		414
498	A-1	H	CF ₃	H	Br	H	188- 190	516
499	A-1	H	F	H	F	H		406
500	A-1	H	F	OCH ₃	H	H	205- 207	418
501	A-1	F	H	F	H	F	*	
502	A-33	H	OCF ₃	H	H	H	153- 155	504
503	A-33	H	OCH ₃	H	H	H		438
604	A-35	H	H	H	H	H		330
605	A-36	H	H	H	H	H		330
606	A-35	H	H	F	H	H	*	
618	A-1	F	F	H	H	F		424
619	A-1	H	CF ₃	H	Cl	F		490
621	A-2	H	SF ₅	H	H	Cl		524
622	A-1	H	OCF ₃	H	Cl	H		488
623	A-37	F	H	H	H	H		432
624	A-37	H	H	F	H	H		432
625	A-37	H	OCF ₃	H	H	H		498
627	A-37	H	CF ₃	H	Br	H		560
629	CH ₂ CO ₂ H	H	H	H	H	H		297
631	A-38	H	H	H	H	H		335
632	A-2	I	H	H	H	H		490
634	A-1	H	CF ₃	H	Cl	H		472
642	A-40	F	H	F	H	H	159- 160	
648	A-40	OCH ₃	H	H	H	H	*	
649	CH ₂ CH ₂ CH	H	H	H	H	H		341
650	CH ₂ CH(OMe) ₂	H	H	H	H	H		327
651	A-2	F	F	H	H	F		418
652	A-2	H	CF ₃	H	Cl	F		484
654	A-1	F	H	OCH ₃	H	H		418
663	A-1	F	Cl	H	H	F		440
664	A-1	OCH ₃	H	H	F	F		436
665	A-2	OCH ₃	H	H	F	F		430
666	A-2	F	Cl	H	H	F		434
673	A-41	H	H	H	H	H		360
674	A-41	F	H	H	H	H		378
675	A-40	F	H	H	H	H		365
676	A-41	H	H	F	H	H		378

化合物	R ²	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
677	A-17	H	H	F	H	H		372
678	A-41	F	H	F	H	H		396
679	A-41	H	OCF ₃	H	H	H		444

*關於¹H NMR數據參見索引表G。

**關於¹H NMR數據參見合成實例。

索引表B



化合物	R ¹	R ²	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
110	Br	CH ₂ CH ₂ CH ₃	*	
111	I	CH ₂ CF ₃	*	
112	I	CH ₂ CH ₂ CH ₃	*	
113	I	A-8	*	
114	I	CH ₂ CF ₂ CF ₃	*	
115	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CF ₃	*	
116	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CF ₃	*	
117	CH ₂ CH ₂ CF=CF ₂	CH ₂ CF ₃	*	
118	I	A-2	**	
125	H	A-1	**	
119	6-氟-3-吡啶基	A-2	*	
120	6-氯-3-吡啶基	A-2	*	
121	3-氯-4-吡啶基	CH ₂ CF ₃	248-249	
521	4-三氟甲基-2-吡啶基	CH ₂ CF ₃	*	
522	4-三氟甲基-2-吡啶基	A-17		417
537	2-溴-4-吡啶基	A-2		443
540	2-溴-4-吡啶基	A-1		449
547	6-三氟甲基-2-吡啶基	A-17	*	
550	2-氟基-4-吡啶基	A-1		396
552	2-吡啶基	CH ₂ CH ₂ CH ₃		282
553	3-吡啶基	CH ₂ CH ₂ CH ₃		282
554	苯基	CH ₂ CO ₂ CH(CH ₃) ₂		339
555	2-萘基	CH ₂ CH ₂ CH ₃		331
556	1-萘基	CH ₂ CH ₂ CH ₃		331
561	4-吡啶基	CH ₂ CH ₂ CH ₃		282
562	2-氯-4-吡啶基	CH ₂ CH ₂ CH ₃		316
564	4-氟-1-萘基	CH ₂ CH ₂ CH ₃	*	

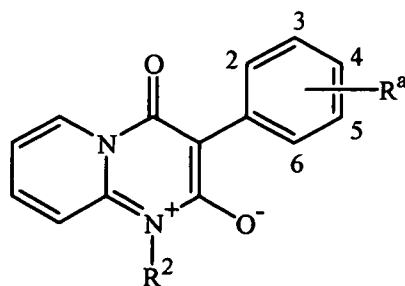
化合物	R ¹	R ²	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
570	6-氟-3-吡啶基	CH ₂ CF ₃		356
571	6-氟-3-吡啶基	CH ₂ CF ₃		340
573	4-氟-1-萘基	A-2		432
574	6-甲氧基-2-萘基	A-2		444
575	6-甲氧基-3-吡啶基	A-2		395
576	5-氟-2-吡啶基	A-2		383
577	5-三氟甲基-3-吡啶基	A-2		433
579	2-氟-3-吡啶基	A-2		383
584	3-氟-4-吡啶基	A-2		383
585	5-甲氧基-2-吡啶基	A-2		395
586	3-氟-2-吡啶基	A-2		383
587	3-氟-2-吡啶基	A-2		399
591	4-三氟甲基-2-吡啶基	A-2		433
593	6-三氟甲基-2-吡啶基	A-2		433
597	4-三氟甲基-2-吡啶基	A-1	225-227	439
598	2-氟-4-吡啶基	A-1	242-243	405
600	6-三氟甲基-2-吡啶基	A-1	*	
608	I	A-1	**	
609	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	**	
610	H	CH ₂ CF ₃	214-215	
611	H	A-2	**	
612	H	A-7	*	
628	2-溴-4-吡啶基	A-37		493
636	2-甲氧基-4-吡啶基	A-1		401
637	C(=NOCH ₃)CF ₃	CH ₂ CF ₃	**	
638	C(=NOCH ₂ CH ₃)CF ₃	CH ₂ CF ₃	*	
653	2-三氟甲基-4-吡啶基	A-1		439
656	C(=NOCH ₂ CHMe ₂)CF ₃	CH ₂ CF ₃	*	
657	C(=NOCMe ₃)CF ₃	CH ₂ CF ₃	*	
658	C(=NOCH ₂ CMe ₃)CF ₃	CH ₂ CF ₃	*	
659	C(=NOCH ₂ CO ₂ Et)CF ₃	CH ₂ CF ₃	*	
660	C(O)NH苯基	A-1		413
661	C(O)NH(3-甲氧基苯基)	A-1		443
687	C(O)OEt	CH ₂ CH ₂ CH ₃		277
688	C(O)NH(4-氟苯基)	CH ₂ CH ₂ CH ₃		342
689	C(O)NH(2-氟苯基)	CH ₂ CH ₂ CH ₃		358
690	C(O)NH(3-氟苯基)	CH ₂ CH ₂ CH ₃		358
691	C(O)NH(4-氟苯基)	CH ₂ CH ₂ CH ₃		358
692	C(O)NH苯基	CH ₂ CH ₂ CH ₃		324
693	C(O)O(4-硝基苯基)	CH ₂ CH ₂ CH ₃		370
694	C(O)苯基	CH ₂ CH ₂ CH ₃		309
695	C(O)(2-氟苯基)	CH ₂ CH ₂ CH ₃		327
696	C(O)(3-氟苯基)	CH ₂ CH ₂ CH ₃		327
697	C(O)(4-氟苯基)	CH ₂ CH ₂ CH ₃		327
698	C(O)(2-甲基苯基)	CH ₂ CH ₂ CH ₃		323

化合物	R ¹	R ²	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
699	C(O)(3-甲基苯基)	CH ₂ CH ₂ CH ₃		323
700	C(O)OEt	A-1	*	
701	C(O)苯基	A-1	*	
702	C(O)CF ₃	A-1	236-238	
703	C(O)(4-氟苯基)	A-1	235-237	
704	C(O)(3-氟苯基)	A-1	226-228	
706	C(O)(2-氟苯基)	A-1	190-192	
707	C(O)[3-(三氟甲基)苯基]	A-1	225-226	
708	C(O)(2-噻吩基)	A-1	214-216	
709	C(O)[4-(三氟甲基)苯基]	A-1	242-243	
710	C(O)CH ₃	A-1	183-185	
711	C(O)CF ₃	CH ₂ CF ₃	202-203	
712	C(O)CF ₃	A-2	209-210	
713	C(O)CF ₂ CF ₃	A-1	204-205	
714	C(O)CF ₂ CF ₃	A-2	189-190	
715	C(O)CF ₂ CF ₂ CF ₃	A-1	156-157	
716	C(O)CF ₂ CF ₂ CF ₃	A-2	134-135	

*關於¹H NMR數據參見索引表G。

**關於¹H NMR數據參見合成實例。

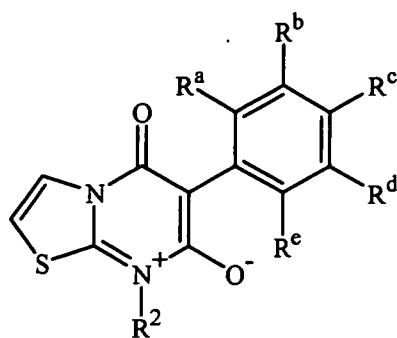
索引表 C



化合物	R ^a	R ²	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
523	3-(3-吡啶基)	A-2		441
524	3-(6-氟-3-吡啶基)	A-2		474
525	3-(6-氟-3-吡啶基)	A-2		459
527	3-(6-氟-3-吡啶基)、6-氟	A-2		477
528	4-(6-氟-3-吡啶基)	A-2		475
529	3-(6-甲氧基-3-吡啶基)	A-2		471
530	3-(6-氟-3-吡啶基)	A-1		481
531	3-(6-氟-3-吡啶基)、 5-三氟甲基	A-2		527
534	3-(6-氟-3-吡啶基)	CH(CH ₃)CF ₃		446
536	3-(6-氟-3-吡啶基)、4-氟	A-2		

化合物	R ^a	R ²	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
539	3-(6-氯-3-吡啶基)、6-甲氧基	A-2		505
541	3-(6-氯-3-吡啶基)、4-氟	A-1		499
542	3-(6-氟-3-吡啶基)	A-1		465
543	3-(6-氯-3-吡啶基)、 5-三氟甲基	A-1		549
544	3-(6-氟-3-吡啶基)、 5-三氟甲基	A-1		533
545	3-(6-氟-3-吡啶基)	A-19		428
546	3-(6-氟-3-吡啶基)	A-6		473
549	3-(6-氟-3-吡啶基)、 5-三氟甲氧基	A-1		549
551	2-(6-氯-3-吡啶基)	A-1		481
557	3-苯基	CH ₂ CH ₂ CH ₃		357
558	4-苯氧基	CH ₂ CH ₂ CH ₃		373
559	2-苯氧基	CH ₂ CH ₂ CH ₃		373
560	2-苯基	CH ₂ CH ₂ CH ₃		357
563	3-苯氧基	CH ₂ CH ₂ CH ₃		373
565	3-苄氧基	CH ₂ CH ₂ CH ₃		387
566	3-苄氧基	CH ₂ CF ₃	178-179	427
567	4-苄氧基	CH ₂ CF ₃	203-204	427
568	2-苄氧基	CH ₂ CF ₃	165-166	427
578	2-(B-1)、4-氟	CH ₂ CF ₃		480
580	3-(B-2)	CH ₂ CF ₃	223-225	428
581	3-(B-1)	CH ₂ CF ₃		462
582	3-(B-1)	A-2		505
594	3-(B-3)、4-氟	A-2		446
595	3-(B-3)、4-氟	CH ₂ CF ₃		446
596	3-(B-4)	CH ₂ CF ₃	170-172	462
616	3-(6-溴-3-吡啶基)	A-1		525
617	3-(6-三氟甲基-3-吡啶基)	A-1		515
626	3-(6-氯-3-吡啶基)	A-37		525
635	3-(6-氯-3-吡啶基)、 5-三氟甲氧基	A-1		565
655	3-(6-氯-3-吡啶基)、5-甲氧基	A-1		511
682	3-(6-三氟甲基-3-吡啶基)、 5-三氟甲氧基	A-1		599
684	3-(6-三氟甲基-3-吡啶基)、 5-三氟甲基	A-1		583
685	3-(6-三氟甲基-3-吡啶基)、 4-甲氧基	A-1		545
717	3-(6-氯-3-吡啶基)、4-甲氧基	A-1		511

索引 D



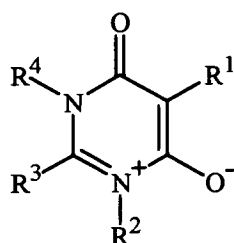
化合物	R ²	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
126	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	H	H	161-168	
127	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	H	H	H	Cl	216-219	
128	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	Cl	H	Cl	H	180-183	
129	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	H	H	H	188-192	
130	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	H	H	H	F	207-210	
131	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	223-225	
132	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	<i>i</i> -Pr	H	H	*	
133	CH ₂ CF ₃	F	H	F	H	H	*	
134	CH ₂ CF ₃	H	H	H	H	H	*	
135	CH ₂ CF ₃	H	OCF ₃	H	H	H	*	
136	A-2	H	H	H	H	H	*	
137	A-2	H	H	F	H	H	*	
138	A-2	H	OCF ₃	H	H	H	**	
139	A-1	H	H	H	H	H	*	
140	A-1	H	H	F	H	H	*	
141	A-1	H	OCF ₃	H	H	H	*	
142	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	H	F	H	H	*	
143	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	Ph	H	H		363
144	CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	H	H		331
145	A-1	H	OCF ₃	H	Br	H		538
146	A-1	F	H	F	H	H		412
147	A-1	H	OCH ₃	H	H	H	*	
148	A-1	F	H	H	Cl	H		428
149	A-2	H	OCH ₃	H	H	H		400
150	A-2	H	OCH ₃	H	OCH ₃	H		430
151	A-2	F	H	F	H	H		406
152	A-1	F	H	H	CF ₃	H	*	
153	A-2	F	H	H	CF ₃	H		456
154	A-2	F	H	H	Cl	H		422
155	A-2	H	OCF ₃	H	Br	H		532
156	A-1	H	OCH ₃	H	OCH ₃	H		436
157	A-2	F	H	H	H	H	216-218	388
158	A-2	OCH ₃	H	H	H	H	99-100	
159	A-1	F	H	H	H	H	192-194	
160	A-1	OCH ₃	H	H	H	H	*	
630	A-17	H	H	H	H	H	223-225	

化合物	R ²	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
633	A-2	I	H	H	H	H		496
639	A-17	H	OCF ₃	H	H	H	*	
640	A-39	H	OCF ₃	H	H	H	147-149	
641	A-17	F	H	F	H	H	235-237	
643	A-17	F	H	H	H	H	223-225	
644	A-39	F	H	H	H	H	169-171	
645	A-39	H	H	H	H	H	190-192	
646	A-17	OCH ₃	H	H	H	H	*	
647	A-39	OCH ₃	H	H	H	H	*	

*關於¹H NMR數據參見索引表G。


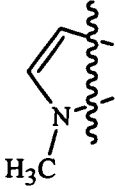
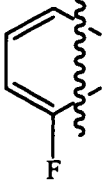
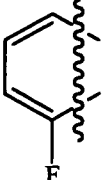
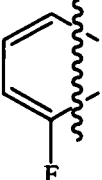
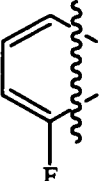
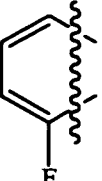

**關於¹H NMR數據參見合成實例。

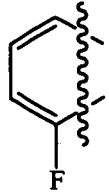
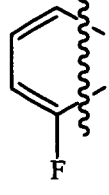
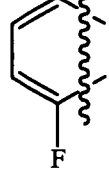
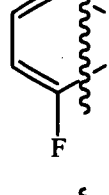
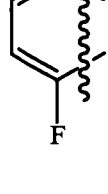
索引表E



化合物	R ¹	R ²	R ³ **	R ⁴ **	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
504	苯基	A-2	CH ₃	苯基		404
505	苯基	A-2	苯基	CH ₃		404
506	4-氟苯基	A-2	CH ₃	苯基		422
507	苯基	CH ₂ CF ₃	苯基	CH ₃		361
508	4-氟苯基	CH ₂ CF ₃	苯基	CH ₃		379
509	苯基	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		259
510	4-氟苯基	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃		276
511	苯基	A-2	CH ₃	CH ₃	*	
512	苯基	CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃		299
513	4-氟苯基	A-2	CH ₃	CH ₃		360
514	苯基	A-1	CH ₃	CH ₃	222-224	388
515	3-三氟甲氧基-苯基	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂			369
516	4-氟苯基	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂			303
517	苯基	A-2				354

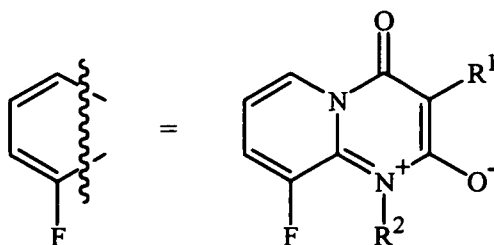


化合物	R ¹	R ²	R ³ **	R ⁴ **	m.p.(°C) *	AP+ (M+1)
518	3-三氟甲氧基-苯基	A-2				
519	苯基	CH ₂ CH ₂ CH ₃				284
588	4-氟苯基	A-2				400
589	3-三氟甲氧基-苯基	A-2				466
590	2,4-二氟苯基	A-2				418
592	苯基	A-2				382
667	2-氟苯基	A-1				406
668	2-氟苯基	A-2				400

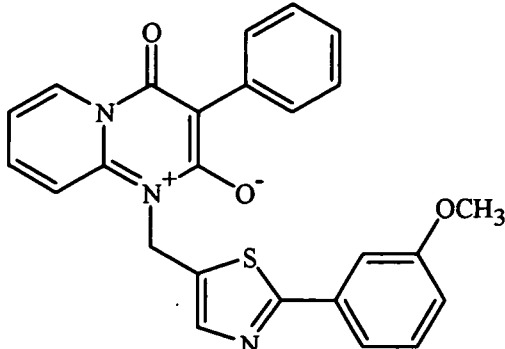
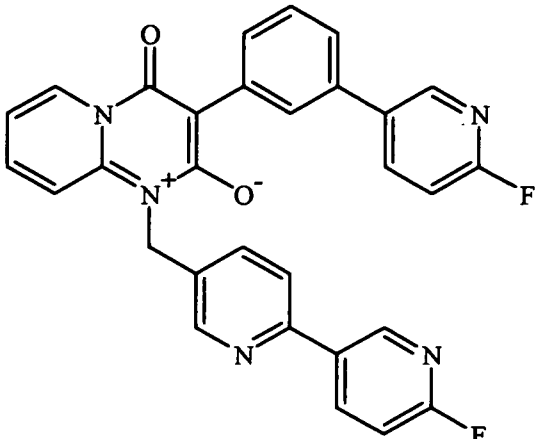
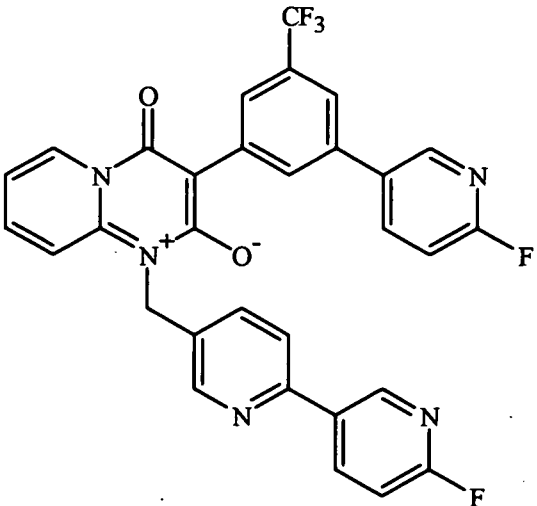
化合物	R ¹	R ²	R ³ **	R ⁴ **	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
669	2-甲氧基苯基	A-2				412
670	2-甲氧基苯基	A-1				418
671	4-氟苯基	A-1				406
672	3-三氟甲氧基-苯基	A-1				472
683	3-溴- 5-(三氟甲氧基) 苯基	A-1				550

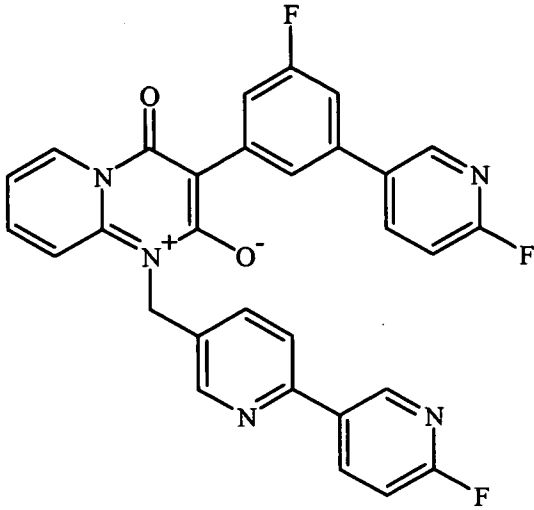
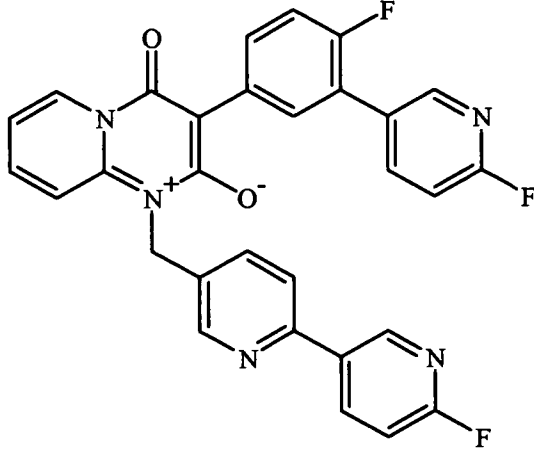
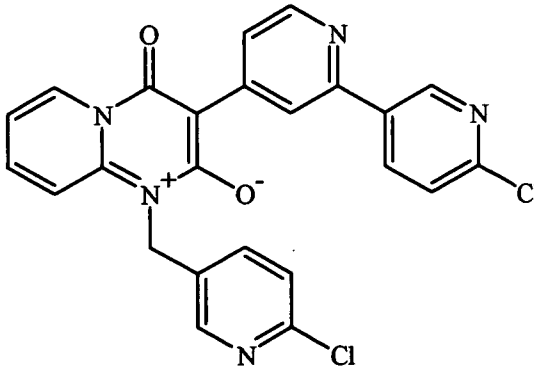
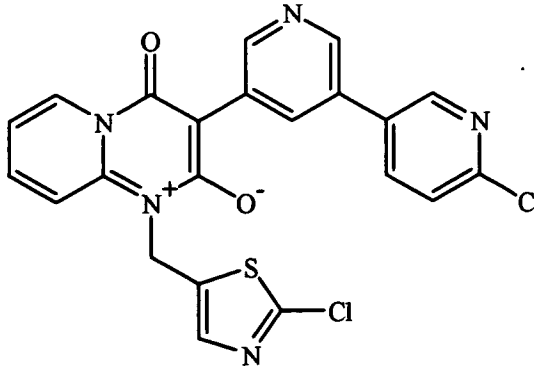
*關於¹H NMR數據參見索引表G。

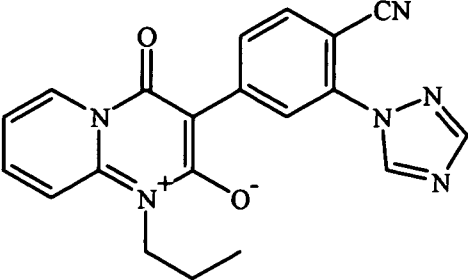
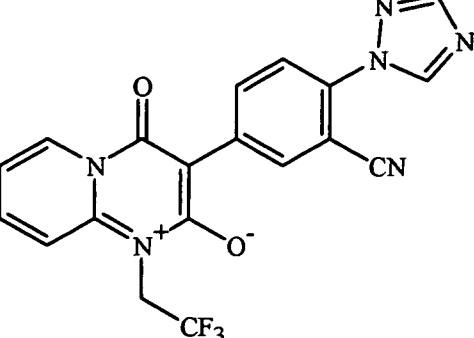
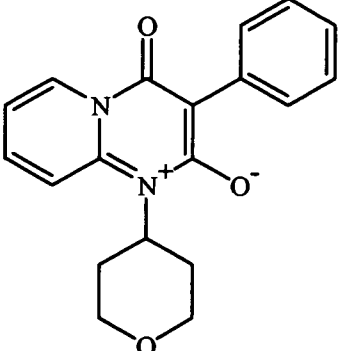
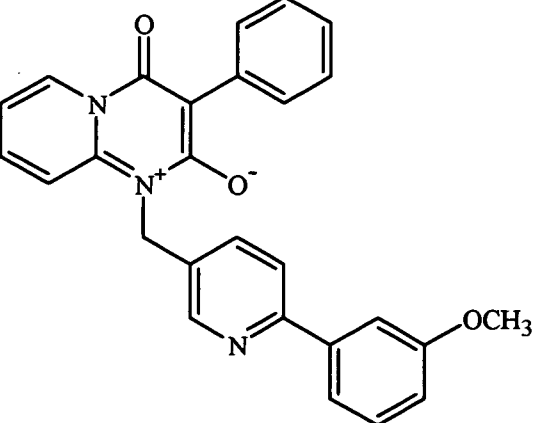
**當R³及R⁴與相鄰連接之氮及碳原子一起形成環時，波形線指示該環連接至分子之其餘部分，其中取向展示如下。



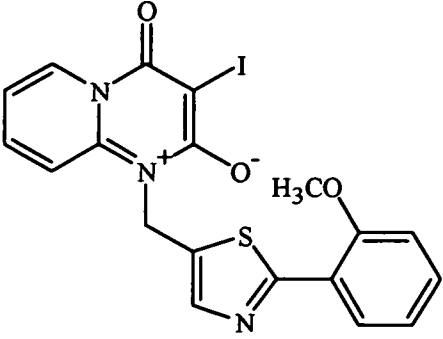
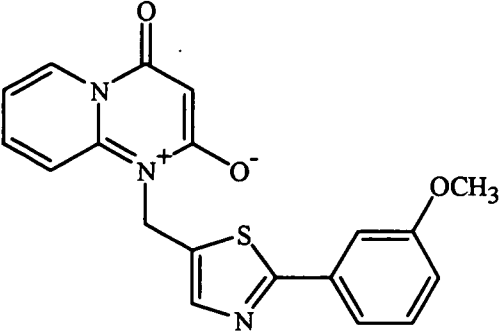
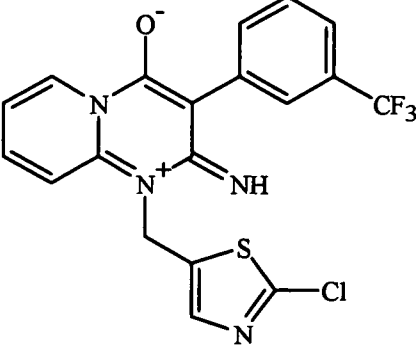
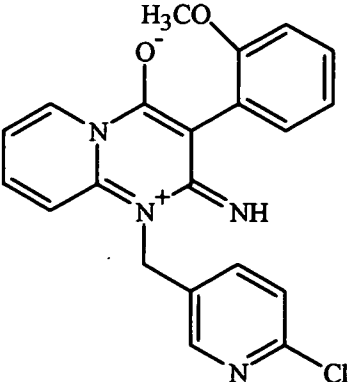
索引表 F

化合物	結構	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
520			442
526			520
532			588

化合物	結構	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
533			538
535			538
538			476
548			482

化合物	結構	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
569		*	
572			413
583		*	
599		*	

化合物	結構	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
601		*	
602			438
603			504
613		**	

化合物	結構	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
614			492
615			366
620		*	
662		**	

化合物	結構	m.p.(°C)	AP+ (M+1)
680		140-141	442
681		139-140	431
686		*	
705			438

*關於¹H NMR數據參見索引表G

**關於¹H NMR數據參見合成實例

索引表 G

化合物編號	¹ H NMR數據 ^{a, b}
3	δ (丙酮-d ₆) 9.5 (m, 1H), 8.5 (m, 1H), 8.1 (m, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.75 (dd, 1H), 7.69 (m, 1H), 7.31 (t, 1H), 7.15 (m, 1H), 5.35 (br s, 2H)。
8	δ 9.51 (d, 1H), 8.09 (m, 1H), 7.85-7.69 (m, 2H), 7.45 (d, 1H), 7.38 (t, 1H), 7.32 (t, 1H), 7.07 (d, 1H), 4.29 (t, 2H), 1.87-1.75 (m, 2H), 1.08 (t, 3H)。
9	δ 9.57 (d, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.49 (t, 2H), 7.41 (d, 1H), 7.29 (d, 1H), 5.2 (br s, 2H)。
10	δ 9.57 (d, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.49 (m, 2H), 6.8-6.95 (m, 2H), 5.2 (br s, 2H)。
12	δ 9.52 (dd, 1H), 8.15-8.07 (m, 2H), 8.03-7.98 (m, 1H), 7.47 (t, 3H), 7.34 (m, 1H), 4.30 (t, 2H), 1.91-1.74 (m, 2H), 1.09 (t, 3H)。
14	δ 9.58 (d, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.51 (t, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.14 (m, 2H)。
15	δ 9.60 (d, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.75 (d, 2H), 7.59 (d, 1H), 7.51 (t, 2H), 7.24 (m, 2H)。
17	δ (丙酮-d ₆) 9.45 (d, 1H), 8.45 (m, 1H), 8.1 (d, 1H), 7.63 (t, 1H), 7.3 (d, 1H), 7.22 (m, 1H), 7.95 (dd, 1H), 6.9 (t, 1H), 5.35 (br s, 2H), 3.73 (s, 3H)。
18	δ 9.5 (m, 1H), 8.1 (m, 1H), 7.75 (m, 2H), 7.63 (dd, 1H), 7.4-7.3 (m, 2H), 7.05 (m, 1H), 4.30 (m, 2H), 1.2 (m, 1H), 0.62 (m, 4H)。
20	δ 9.51 (dd, 1H), 8.12 (ddd, 2H), 7.51-7.42 (m, 3H), 7.38-7.31 (m, 1H), 6.72-6.60 (m, 1H), 4.29 (t, 2H), 1.93-1.68 (m, 2H), 1.09 (t, 3H)。
21	δ 9.56 (d, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.49 (m, 2H), 7.16 (t, 2H), 5.2 (br s, 2H)。
22	δ 9.57 (d, 1H), 8.19 (t, 1H), 7.78 (dd, 1H), 7.67 (dd, 1H), 7.35-7.55 (m, 3H), 7.09 (d, 1H), 4.7-5.05 (m, 2H), 4.37 (m, 1H), 2.2-2.55 (m, 2H)。
25	δ 9.57 (d, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.46 (t, 2H), 7.38(s, 1H), 6.90 (d, 1H), 3.79 (s, 3H)。
27	δ 9.57 (d, 1H), 8.17 (t, 1H), 7.74 (m, 2H), 7.49 (d, 1H), 7.41 (t, 1H), 7.08 (t, 2H), 4.7-5.05 (m, 2H), 4.37 (m, 1H), 2.2-2.55 (m, 2H)。
28	δ 9.53 (dd, 1H), 8.07 (ddd, 1H), 7.81-7.72 (m, 2H), 7.45 (d, 1H), 7.42-7.36 (m, 2H), 7.31 (m, 1H), 7.25-7.20 (m, 1H), 4.30 (d, 1H), 1.90-1.73 (m, 2H), 1.08 (t, 3H)。
30	δ 9.54 (d, 1H), 8.21 (t, 1H), 7.51 (m, 2H), 7.42 (t, 1H), 6.9 (m, 2H), 4.7-5.05 (m, 2H), 4.37 (m, 1H), 2.2-2.55 (m, 2H)。
32	δ 9.61 (d, 1H), 8.24 (t, 1H), 7.78 (dd, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.50 (t, 1H), 7.44 (d, 2H), 6.69 (t, 1H)。

- 33 δ 9.61 (d, 1H), 8.21 (t, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.71 (s, 1H), 7.55 (dt, 1H), 7.49 (t, 1H), 7.39 (t, 1H), 7.10 (d, 1H) °
- 34 δ 9.59 (d, 1H), 8.15 (t, 1H), 7.72 (d, 2H), 7.52 (d, 1H), 7.44 (t, 1H), 7.38 (t, 2H), 7.23 (t, 1H), 5.5 (br s, 2H) °
- 35 δ 9.61 (d, 1H), 8.21 (t, 1H), 7.73 (m, 2H), 7.56 (d, 1H), 7.49 (t, 1H), 7.08 (t, 2H) °
- 36 δ 9.59 (d, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.50 (m, 2H), 7.50 (t, 1H), 6.85-6.95 (m, 2H) °
- 37 δ 9.57 (d, 1H), 8.13 (t, 1H), 7.74 (d, 2H), 7.49 (d, 1H), 7.40 (m, 3H), 7.26 (m, 1H), 4.54 (t, 2H), 2.85 (m, 2H) °
- 38 δ 9.58 (d, 1H), 8.16 (t, 1H), 7.74 (d, 2H), 7.49 (d, 1H), 7.40 (t, 3H), 7.25 (m, 1H), 4.58 (dd, 2H), 2.85 (m, 2H) °
- 39 δ 9.49 (dd, 1H), 8.03 (ddd, 1H), 7.73 (d, 2H), 7.58 (d, 1H), 7.36 (t, 2H), 7.28 (m, 1H), 7.23-7.17 (m, 1H), 4.28 (d, 2H), 1.24-1.09 (m, 1H), 0.69-0.45 (m, 4H) °
- 41 δ 9.51 (dd, 1H), 8.13 (ddd, 1H), 8.03-7.97 (m, 2H), 7.68-7.62 (m, 2H), 7.48 (d, 1H), 7.39-7.33 (m, 1H), 4.29 (t, 2H), 1.90-1.72 (m, 2H), 1.09 (t, 3H) °
- 42 δ 9.55 (m, 1H), 8.15 (m, 1H), 7.75 (m, 2H), 7.67 (s, 1H), 7.6 (dd, 1H), 7.42 (m, 1H), 7.1 (m, 2H), 5.58 (br s, 2H) °
- 44 δ 9.5 (m, 1H), 8.15 (m, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.6 (dd, 1H), 7.5 (m, 1H), 7.4 (m, 1H), 6.9 (m, 2H), 5.55 (br s, 2H) °
- 50 δ (丙酮- d_6) 9.4 (m, 1H), 8.45 (m, 1H), 8.1 (dd, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.6 (m, 1H), 7.55 (m, 1H), 7.3 (m, 1H), 7.1 (m, 2H), 5.74 (d, 2H) °
- 51 δ 9.54 (d, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.07 (dd, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.25-7.45 (m, 5H), 5.58 (br s, 2H) °
- 52 δ 9.55 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.10 (m, 3H), 7.67 (d, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.42 (m, 2H), 7.36 (d, 1H), 5.59 (br s, 2H) °
- 53 δ 9.56 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.09 (dd, 1H), 8.07 (d, 1H), 7.69 (dd, 1H), 7.51 (m, 2H), 7.40 (m, 2H), 5.6 (br s, 2H) °
- 54 δ 9.56 (d, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.08 (dd, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.68 (dd, 1H), 7.3-7.45 (m, 4H), 7.12 (d, 1H), 5.59 (br s, 2H) °
- 55 δ 9.52 (d, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.10 (dd, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.66 (dd, 1H), 7.3-7.45 (m, 4H), 5.57 (br s, 2H) °
- 56 δ 9.55 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.08 (dd, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.77 (dd, 1H), 7.3-7.45 (m, 4H), 7.24 (d, 1H), 5.59 (br s, 2H) °
- 57 δ 9.56 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.05 (dd, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.77 (dd, 1H), 7.3-7.45 (m, 4H), 7.24 (d, 1H), 5.59 (br s, 2H) °
- 59 δ 9.56 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.05 (dd, 1H), 7.79 (d, 2H), 7.70 (dd, 1H), 7.2-7.45 (m, 6H), 5.59 (br s, 2H) °

- 60 δ 9.56 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.05 (dd, 1H), 7.81 (d, 2H), 7.69 (dd, 1H), 7.3-7.45 (m, 3H), 7.17 (d, 2H), 6.52 (t, 1H), 5.59 (br s, 2H) °
- 61 δ 9.56 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.08 (dd, 1H), 7.70 (dd, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.58 (m, 1H), 7.3-7.45 (m, 4H), 6.95 (td, 1H), 5.58 (br s, 2H) °
- 62 δ 9.51 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.10 (dd, 1H), 7.10 (m, 2H), 7.3-7.45 (m, 4H), 7.03 (dd, 1H), 5.58 (br s, 2H) °
- 63 δ 9.51 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.08 (dd, 1H), 7.69 (ddd, 1H), 7.54 (q, 1H), 7.3-7.45 (m, 4H), 6.85-7.0 (m, 2H), 5.57 (br s, 2H) °
- 64 δ 9.52 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.10 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.48 (dd, 1H), 7.42 (m, 2H), 7.34 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.06 (td, 1H), 5.59 (br s, 2H) °
- 66 δ 9.53 (d, 1H), 8.49 (s, 1H), 8.12 (dd, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.69 (dd, 1H), 7.65 (m, 1H), 7.2-7.45 (m, 4H), 5.59 (br s, 2H) °
- 67 δ 9.53 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.11 (dd, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.70 (dd, 1H), 7.51 (d, 1H), 7.4 (m, 3H), 7.35 (d, 1H), 7.15 (d, 1H), 5.75 (br d, 1H), 5.4 (br d, 1H) °
- 68 δ 9.53 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.11 (dd, 1H), 7.79 (t, 1H), 7.69 (dd, 1H), 7.25-7.45 (m, 4H), 5.58 (br s, 2H) °
- 70 δ 9.52 (d, 1H), 8.49 (s, 1H), 8.10 (dd, 1H), 7.69 (dd, 1H), 7.56 (dd, 1H), 7.4 (m, 2H), 7.09 (t, 1H), 5.58 (br s, 2H) °
- 72 δ 9.50 (d, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.03 (dd, 1H), 7.69 (dd, 1H), 7.57 (td, 1H), 7.26-7.45 (m, 4H), 7.19 (t, 1H), 7.12 (dd, 1H), 5.56 (br s, 2H) °
- 73 δ 9.56 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.08 (dd, 1H), 7.86 (d, 2H), 7.69 (dd, 1H), 7.3-7.45 (m, 3H), 7.26 (d, 1H), 5.59 (br s, 2H) °
- 74 δ 9.54 (d, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.0-8.15 (m, 3H), 7.67 (dd, 1H), 7.4 (m, 2H), 7.33 (d, 1H), 7.21 (dd, 1H), 5.59 (br s, 2H) °
- 75 δ 9.56 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.03 (dd, 1H), 7.74 (d, 2H), 7.69 (dd, 1H), 7.3-7.4 (m, 3H), 6.97 (d, 2H), 5.59 (br s, 2H) °
- 76 δ 9.56 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.10 (dd, 1H), 7.97 (d, 2H), 7.6-7.75 (m, 3H), 7.41 (m, 2H), 7.33 (d, 1H), 5.60 (br s, 2H) °
- 77 δ 9.50 (d, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.08 (dd, 1H), 7.68 (dd, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.3-7.45 (m, 5H), 5.7 (br d, 1H), 5.4 (br d, 1H) °
- 78 δ 9.52 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.11 (dd, 1H), 7.68 (dd, 2H), 7.35-7.45 (m, 3H), 7.34 (d, 1H), 6.95-7.05 (m, 1H), 5.57 (br s, 2H) °
- 79 δ 9.52 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.12 (dd, 1H), 7.65-7.75 (m, 2H), 7.47 (d, 1H), 7.42 (t, 2H), 7.37 (d, 1H), 5.58 (br s, 2H) °
- 80 δ 9.51 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.12 (dd, 1H), 7.69 (dd, 1H), 7.4-7.5 (m, 2H), 7.33 (d, 1H), 7.27 (m, 1H), 7.02 (dd, 1H), 5.58 (br s, 2H) °
- 82 δ 9.55 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.09 (dd, 1H), 7.65-7.75 (m, 2H), 7.6 (m, 1H), 7.41 (m, 2H), 7.33 (d, 1H), 7.17 (q, 1H), 5.58 (br s, 2H) °

- 83 δ 9.56 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.05 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.28-7.40 (m, 6H), 6.84 (m, 1H), 5.59 (br s, 2H), 3.84 (s, 3H) °
- 84 δ 9.56 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.03 (dd, 1H), 7.68 (m, 3H), 7.36 (m, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.23 (d, 1H), 5.58 (br s, 2H), 2.37 (s, 3H) °
- 85 δ 9.52 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.10 (dd, 1H), 7.68 (dd, 2H), 7.3-7.5 (m, 6H), 5.57 (br s, 2H) °
- 86 δ (丙酮- d_6) 9.45 (d, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.25 (m, 1H), 7.9-7.8 (m, 2H), 7.75 (s, 1H), 7.6 (dd, 1H), 7.5 (m, 1H), 7.4 (d, 1H), 6.65 (d, 1H), 5.72 (br s, 2H), 4.53 (m, 2H), 3.2 (m, 2H) °
- 87 δ 9.59 (d, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.10 (dd, 1H), 7.8 (m, 3H), 7.42 (t, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.11 (t, 2H), 5.59 (br s, 2H) °
- 88 δ 9.53 (d, 1H), 8.49 (s, 1H), 8.10 (dd, 1H), 7.70 (dd, 1H), 7.26-7.45 (m, 4H), 7.10 (td, 1H), 7.00 (m, 1H), 5.58 (br s, 2H) °
- 89 δ 9.51 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.10 (dd, 1H), 7.70 (dd, 1H), 7.28-7.45 (m, 4H), 7.12 (m, 2H), 5.57 (br s, 2H) °
- 90 δ 9.53 (d, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.13 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.53 (s, 2H), 7.43 (m, 2H), 7.35 (d, 1H), 5.60 (br d, 2H) °
- 91 δ 9.52 (d, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.06 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.3-7.55 (m, 5H), 7.25 (d, 1H), 5.6 (br dd, 2H), 2.26 (s, 3H) °
- 92 δ 9.54 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.1 (m, 2H), 7.75 (m, 1H), 7.68 (dd, 1H), 7.4 (m, 3H), 7.37 (d, 1H), 7.15 (t, 1H), 5.58 (br s, 2H) °
- 93 δ 9.55 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.25 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.11 (dd, 1H), 7.66 (m, 2H), 7.4 (m, 2H), 7.34 (d, 1H), 5.59 (br s, 2H) °
- 94 δ 9.53 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.14 (t, 1H), 7.75 (t, 1H), 7.68 (dd, 1H), 7.51 (d, 1H), 7.4 (m, 3H), 7.34 (d, 1H), 5.58 (br s, 2H) °
- 95 δ 9.53 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.07 (t, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.47 (t, 1H), 7.38 (m, 2H), 7.32 (d, 1H), 6.75 (m, 2H), 5.58 (br s, 2H) °
- 96 δ 9.53 (d, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.08 (dd, 1H), 7.69 (t, 1H), 7.3-7.45 (m, 4H), 6.9-7.05 (m, 2H), 5.6 (br dd, 2H), 2.28 (s, 3H) °
- 97 δ 9.52 (d, 1H), 8.77 (s, 1H), 8.34 (t, 1H), 8.08 (dd, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.78 (m, 2H), 7.4 (m, 2H), 7.10 (d, 1H), 5.67 (br s, 2H), 2.55 (s, 3H) °
- 98 δ 9.55 (dd, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.04 (ddd, 1H), 7.69 (dd, 1H), 7.40-7.34 (m, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.29-7.26 (m, 2H), 6.88 (d, 1H), 5.95 (s, 2H), 5.58 (br s, 2H) °
- 99 δ 9.52 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.10 (dd, 1H), 7.72 (dd, 1H), 7.3-7.5 (m, 5H), 7.11 (td, 1H), 5.8 (br d, 1H), 5.4 (br d, 1H) °
- 100 δ 9.58 (d, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.07 (dd, 1H), 7.8 (m, 3H), 7.3-7.45 (m, 4H), 7.26 (m, 1H), 5.57 (br s, 2H) °
- 101 δ 9.56 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.07 (dd, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.3-7.45 (m, 4H), 7.12 (dd, 1H), 5.59 (br s, 2H), 3.93 (s, 3H) °

- 102 δ 9.55 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.05 (dd, 1H), 7.55-7.95 (m, 3H), 7.3-7.45 (m, 3H), 7.02 (dd, 1H), 5.58 (br s, 2H), 3.91 (s, 3H) °
- 103 δ 9.53 (d, 1H), 8.69 (s, 1H), 8.60 (d, 1H), 8.07 (m, 2H), 7.80 (s, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.4 (m, 2H), 7.25 (m, 2H), 5.63 (br s, 2H) °
- 104 δ 9.55 (d, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.07 (dd, 1H), 7.65-7.75 (m, 3H), 7.53 (d, 2H), 7.51 (d, 1H), 7.4 (m, 2H), 7.32 (d, 1H), 5.58 (br s, 2H) °
- 105 δ 9.56 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.12 (dd, 1H), 8.02 (d, 2H), 7.67 (d, 2H), 7.4 (m, 3H), 7.34 (d, 1H), 5.59 (br s, 2H) °
- 106 δ 9.55 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.07 (dd, 1H), 7.78 (d, 2H), 7.69 (dd, 1H), 7.4 (m, 4H), 7.32 (d, 1H), 5.59 (br s, 2H) °
- 107 δ 9.53 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.20 (s, 1H), 8.11 (m, 2H), 7.68 (dd, 1H), 7.4-7.55 (m, 4H), 7.34 (d, 1H), 5.59 (br s, 2H) °
- 108 δ 9.51 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.11 (dd, 1H), 7.68 (dd, 1H), 7.4 (m, 3H), 7.34 (d, 1H), 6.76 (dd, 2H), 5.58 (br s, 2H) °
- 109 δ 9.57 (d, 1H), 8.46 (s, 1H), 7.88 (dd, 1H), 7.77 (m, 2H), 7.57 (dd, 1H), 7.3 (m, 3H), 7.1 (m, 3H), 5.35 (br m, 1H), 2.00 (s, 3H) °
- 110 δ 9.46 (dd, 1H), 8.14 (ddd, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.36 (m, 1H), 4.31 (t, 2H), 1.87-1.70 (m, 2H), 1.07 (t, 3H) °
- 111 δ 9.54 (d, 1H), 8.26 (dd, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.49 (t, 1H), 5.12 (br s, 2H) °
- 112 δ 9.45 (d, 1H), 8.14 (dd, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.33 (t, 1H), 4.32 (t, 2H), 1.78 (m, 2H), 1.07 (t, 3H) °
- 113 δ 9.50 (d, 1H), 8.23 (dd, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.41 (t, 1H), 4.96 (m, 1H), 4.77 (m, 1H), 4.40 (m, 1H), 2.40 (m, 1H), 2.25 (m, 1H) °
- 114 δ (丙酮- d_6) 9.42 (d, 1H), 8.53 (m, 1H), 8.09 (d, 1H), 7.69 (t, 1H), 5.42 (br s, 2H) °
- 115 δ 8.12 (d, 1H), 7.45 (dd, 1H), 6.68 (dd, 1H), 6.48 (d, 1H), 4.6 (br s, 2H), 2.4 (m, 1H), 1.01 (d, 6H) °
- 116 δ 8.12 (d, 1H), 7.45 (dd, 1H), 6.68 (dd, 1H), 6.49 (d, 1H), 4.6 (br s, 2H), 1.6 (m, 1H), 0.92 (d, 6H) °
- 117 δ 9.51 (d, 1H), 8.18 (dd, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.46 (t, 1H), 5.10 (br s, 2H), 2.91 (t, 2H), 2.60 (m, 2H) °
- 118 δ 9.49 (d, 1H), 8.45 (s, 1H), 8.12 (dd, 1H), 7.65 (dd, 1H), 7.4 (m, 2H), 7.32 (d, 1H), 5.60 (br s, 2H) °
- 119 δ 9.55 (d, 1H), 8.71 (s, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.30 (dd, 1H), 8.11 (dd, 1H), 7.67 (dd, 1H), 7.42 (m, 2H), 7.33 (d, 1H), 5.60 (br s, 2H) °
- 120 δ 9.56 (d, 1H), 8.92 (s, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.21 (dd, 1H), 8.11 (dd, 1H), 7.3-7.45 (m, 4H), 5.59 (br s, 2H) °
- 132 δ 8.23 (d, 1H), 7.64 (d, 2H), 7.23 (d, 2H), 4.06 (dd, 2H), 2.89 (m, 1H), 1.89 (q, 2H), 1.25 (d, 6H), 1.06 (t, 3H) °
- 133 δ 8.30 (d, 1H), 7.46 (m, 1H), 7.16 (d, 1H), 6.8-6.9 (m, 2H), 4.8 (br s, 2H) °

- 134 δ 8.32 (d, 1H), 7.72 (d, 2H), 7.38 (dd, 2H), 7.23 (dd, 1H), 7.13 (d, 1H), 4.81 (q, 2H) °
- 135 δ 8.32 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.69 (s, 1H), 7.37 (t, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.08 (d, 1H), 4.81 (q, 2H) °
- 136 δ 8.52 (d, 1H), 8.28 (d, 1H), 7.91 (dd, 1H), 7.72 (d, 2H), 7.35-7.4 (m, 3H), 7.25 (m, 1H, 經溶劑峰部分遮掩), 7.03 (d, 1H), 5.31 (s, 2H) °
- 137 δ (丙酮- d_6) 8.61 (d, 1H), 8.20 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.89 (m, 2H), 7.55 (dd, 1H), 7.47 (m, 1H), 7.03 (dd, 2H), 5.46 (s, 2H) °
- 138 δ 8.49 (d, 1H), 8.23 (d, 1H), 7.86 (dd, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.37 (dd, 2H), 7.08 (d, 1H), 7.03 (d, 1H), 5.29 (s, 2H) °
- 139 δ 8.29 (d, 1H), 7.67-7.72 (m, 3H), 7.25 (m, 1H, 經溶劑峰部分遮掩), 7.09 (d, 1H), 5.34 (s, 2H) °
- 140 δ 8.28 (d, 1H), 7.67-7.73 (m, 3H), 7.04-7.11 (m, 3H), 5.33 (s, 2H) °
- 141 δ 8.25 (s, 1H), 7.65-7.75 (m, 3H), 7.38 (dd, 1H), 7.08 (d, 1H), 5.32 (d, 1H) °
- 142 δ 8.01 (d, 1H), 7.39 (m, 1H), 6.95 (d, 1H), 6.92-6.88 (m, 2H), 4.31 (m, 2H), 1.70 (m, 2H), 0.92 (t, 3H) °
- 147 δ 8.27 (d, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.31 (m, 3H), 7.07 (d, 1H), 6.80 (m, 1H), 5.33 (s, 2H), 3.82 (s, 3H) °
- 152 δ 8.27 (d, 1H), 7.82 (m, 1H), 7.69 (s, 1H), 7.56 (m, 1H), 7.23 (m, 1H), 7.14 (d, 1H), 5.35 (s, 2H) °
- 160 δ (丙酮- d_6) 8.17 (d, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.21-7.29 (m, 2H), 6.99 (d, 1H), 6.88 (t, 1H), 5.45 (d, 2H), 3.76 (s, 3H) °
- 171 δ 9.49 (dd, 1H), 8.18 (t, 1H), 7.65-7.75 (m, 2H), 7.38-7.49 (m, 2H), 4.31 (d, 2H), 1.15-1.22 (m, 1H), 0.62 (m, 4H) °
- 209 δ (丙酮- d_6) 9.45 (d, 1H), 8.48 (t, 1H), 8.13 (d, 1H), 7.63 (t, 1H), 6.98-7.08 (m, 3H), 5.38 (br d, 2H), 3.87 (s, 3H) °
- 229 δ 9.58 (d, 1H), 8.02 (t, 1H), 7.47-7.59 (m, 3H), 7.38 (t, 1H), 7.15-7.35 (m, 4H), 2.01 (d, 3H) °
- 345 δ 9.47 (dd, 1H), 8.08 (d, 1H), 7.68 (m, 1H), 7.45-7.55 (m, 3H), 7.31 (t, 2H), 7.00 (d, 2H), 4.15-4.4 (m, 2H), 4.11 (q, 2H), 1.7-1.85 (m, 2H), 1.31 (t, 3H), 1.07 (t, 3H) °
- 346 δ 9.55 (dd, 1H), 8.17 (t, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.52 (dd, 1H), 7.45 (t, 1H), 6.99 (d, 1H), 5.3 (br s, 1H), 4.9 (br s, 1H), 4.10 (q, 2H), 1.31 (t, 3H) °
- 348 δ 9.49 (dd, 1H), 8.11 (t, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.34 (m, 2H), 7.13 (s, 1H), 4.32 (m, 2H), 3.71 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 1.7-1.85 (m, 2H), 1.06 (t, 3H) °
- 349 δ 9.49 (d, 1H), 8.05 (t, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.29 (t, 1H), 7.16 (m, 2H), 7.01 (d, 1H), 4.31 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.7-1.85 (m, 2H), 1.06 (t, 3H) °
- 351 δ 9.55 (d, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.98 (d, 2H), 7.66 (d, 2H), 7.52 (d, 1H), 7.44 (t, 1H), 4.85-5.05 (m, 1H), 4.75 (m, 1H), 4.40 (m, 1H), 2.2-2.6 (m, 2H) °

- 352 δ 9.59 (dd, 1H), 8.25 (t, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.50 (t, 1H), 7.23-7.28 (m, 1H), 7.07 (td, 1H), 7.04 (m, 1H), 5.10 (br s, 2H) °
- 369 δ 9.60 (dd, 1H), 8.26 (t, 1H), 8.16 (d, 1H), 8.12 (m, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.53 (t, 1H), 7.20 (t, 1H), 5.10 (br s, 2H) °
- 416 δ 9.51 (d, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.08 (d, 2H), 7.75 (d, 2H), 7.66 (dd, 2H), 7.3-7.45 (m, 3H), 7.2-7.25 (m, 1H), 5.69 (s, 2H) °
- 418 δ 9.54 (dd, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.10 (m, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.67 (dd, 1H), 7.33-7.43 (m, 2H), 7.2-7.3 (m, 3H), 5.58 (br s, 2H) °
- 425 δ 9.56 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.06 (t, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.66 (dd, 2H), 7.3-7.4 (m, 3H), 7.19 (d, 1H), 5.59 (br s, 1H), 2.51 (s, 3H) °
- 426 δ 9.62 (dd, 1H), 8.75 (t, 1H), 8.26 (m, 1H), 8.20 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.53 (m, 2H), 5.3 (br s, 2H) °
- 427 δ 9.57 (dd, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.04 (m, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.70 (dd, 2H), 7.42 (s, 2H), 7.35 (m, 3H), 5.60 (br s, 2H), 0.29 (s, 9H) °
- 430 δ 9.56 (dd, 1H), 8.76 (s, 1H), 8.04 (m, 1H), 7.93 (d, 1H), 7.7-7.8 (m, 3H), 7.60 (m, 3H), 7.34 (m, mH), 5.65 (br s, 2H), 0.28 (s, 9H) °
- 433 δ 9.58 (d, 1H), 8.22 (m, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.48 (t, 1H), 7.30 (m, 1H), 6.98 (d, 1H), 6.93 (m, 1H), 5.2 (br s, 2H), 2.24 (s, 3H) °
- 436 δ 9.58 (dd, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.11 (t, 1H), 7.80 (m, 3H), 7.42 (m, 2H), 7.36 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 5.58 (br s, 2H) °
- 443 δ 9.59 (dd, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.07 (t, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.74 (d, 2H), 7.40 (t, 1H), 7.37 (d, 1H), 6.98 (d, 2H), 5.58 (br s, 2H), 3.84 (s, 3H) °
- 453 δ 9.58 (dd, 1H), 8.12 (m, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.42 (m, 2H), 7.26 (m, 2H), 7.12 (d, 1H), 5.67 (br s, 2H) °
- 459 δ 9.55 (d, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.05 (t, 1H), 7.66 (dd, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.31-7.39 (m, 4H), 6.85 (d, 1H), 5.59 (br s, 2H), 4.38 (q, 2H) °
- 483 δ 9.57 (dd, 1H), 8.15 (m, 1H), 7.74 (m, 2H), 7.59 (d, 1H), 7.40 (t, 1H), 7.08 (t, 2H), 5.0 (m, 1H), 4.0 (m, 1H), 2.07 (m, 1H), 1.5-1.65 (m, 4H) °
- 486 δ (丙酮- d_6) 9.43 (d, 1H), 8.41 (t, 1H), 8.18 (d, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.59 (t, 1H), 7.50-7.56 (m, 1H), 7.05 (dd, 1H), 5.77 (s, 2H), 3.88 (s, 3H) °
- 501 δ 9.51 (d, 1H), 8.21 (t, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.42 (t, 1H), 6.75 (t, 2H), 5.59 (s, 2H) °
- 511 δ (丙酮- d_6) 7.87 (dd, 1H), 7.84-7.82 (m, 2H), 7.50 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.25-7.21 (m, 2H), 7.10-7.05 (m, 1H), 5.58 (s, 2H), 3.64 (s, 3H), 2.29 (s, 3H) °
- 518 δ (丙酮- d_6) 8.60 (d, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.04 (s, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.92-7.97 (m, 2H), 7.43 (d, 1H), 7.38 (t, 1H), 7.03 (d, 1H), 5.42 (s, 2H) °
- 521 δ (丙酮- d_6) 9.50 (d, 1H), 8.85 (d, 1H), 8.55 (t, 1H), 8.17 (d, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.71 (t, 1H), 7.45 (d, 1H), 5.39 (br d, 2H) °
- 547 δ (丙酮- d_6) 9.41 (d, 1H), 8.35-8.43 (m, 2H), 7.98-8.05 (m, 2H), 7.88-7.92 (m, 2H), 7.63 (d, 1H), 7.59 (t, 1H), 7.05 (d, 1H), 5.74 (s, 2H) °

- 564 δ 9.53 (dd, 1H), 8.14 (m, 1H), 7.73 (m, 2H), 7.4-7.6 (m, 4H), 7.36 (t, 2H), 7.20 (m, 1H), 5.58 (br s, 2H), 4.32 (m, 2H), 1.84 (m, 2H), 1.09 (t, 3H)。
- 569 δ 9.48 (dd, 1H), 8.70 (s, 1H), 8.43 (d, 1H), 8.22 (d, 1H), 8.17 (m, 2H), 7.78 (d, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.37 (t, 1H), 4.3 (t, 2H), 1.83 (m, 2H), 1.09 (t, 3H)。
- 583 δ (丙酮- d_6) 9.42 (dd, 1H), 8.35 (t, 1H), 8.15 (d, 1H), 7.82 (d, 2H), 7.52 (t, 1H), 7.25-7.31 (m, 2H), 7.13 (t, 1H), 5.34 (Br s, 1H), 4.05 (dd, 2H), 3.58 (td, 2H), 2.91 (qd, 2H), 1.80 (dd, 2H)。
- 599 δ 9.57 (dd, 1H), 8.76 (d, 1H), 8.03 (m, 1H), 7.7-7.83 (m, 4H), 7.34-7.57 (m, 6H), 7.2-7.3 (m, 2H), 6.98 (dd, 1H), 5.65 (br s, 2H)。
- 600 δ (丙酮- d_6) 9.41 (d, 1H), 8.45 (t, 1H), 8.20 (d, 1H), 7.95-8.05 (m, 2H), 7.88 (d, 1H), 7.59-7.65 (m, 2H), 5.75 (br s, 2H)。
- 601 δ 9.57 (dd, 1H), 9.14 (s, 1H), 8.52 (s, 1H), 8.05-8.10 (m, 2H), 7.91 (s, 26H), 7.78-7.82 (m, 2H), 7.38-7.43 (d, 2H), 7.11 (t, 2H), 5.67 (Br s, 2H)。
- 606 δ 9.49 (d, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.05 (s, 2H), 7.78 (m, 2H), 7.68 (t, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.33 (m, 1H), 7.09 (t, 2H), 5.68 (br s, 2H)。
- 612 δ 9.44 (dd, 1H), 8.65 (d, 1H), 8.57 (dd, 1H), 8.03 (m, 1H), 7.62 (dt, 1H), 7.27-7.37 (m, 3H), 5.55 (br s, 2H), 5.47 (s, 1H)。
- 620 δ (丙酮- d_6) 9.48 (d, 1H), 8.44 (dd, 1H), 8.37 (s, 1H), 8.25 (d, 1H), 8.22 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.64-7.48 (m, 4H), 5.78 (s, 2H)。
- 638 δ 9.49 (d, 0.5H), 9.47 (d, 0.5H), 8.23 (t, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.50 (m, 1H), 5.00 (m, 2H), 4.35 (q, 1H), 4.32 (q, 1H), 1.35 (t, 1.5H), 1.28 (t, 1.5H) (E與Z異構體之1:1混合物)。
- 639 δ (丙酮- d_6) 8.45 (d, 1H), 8.19 (m, 1H), 8.10 (m, 1H), 8.00 (m, 2H), 7.53 (m, 1H), 7.38 (m, 1H), 7.10-7.00 (m, 2H), 5.45 (s, 2H)。
- 646 δ (丙酮- d_6) 8.45 (s, 1H), 8.10 (m, 2H), 7.50 (m, 1H), 7.30 (m, 1H), 7.20 (m, 1H), 7.15 (m, 1H), 6.95 (m, 1H), 6.90 (m, 1H), 5.50-5.30 (dd, 2H), 3.76 (s, 3H)。
- 647 δ (丙酮- d_6) 8.10 (m, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.20 (m, 1H), 6.95 (m, 1H), 6.90 (m, 1H), 5.13 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.74 (s, 3H)。
- 648 δ (丙酮- d_6) 9.40 (m, 1H), 8.10 (m, 1H), 7.70 (m, 1H), 7.60 (dd, 1H), 7.45-7.35 (m, 3H), 7.20 (m, 1H), 7.05 (m, 1H), 6.95 (m, 1H), 6.90 (m, 1H), 3.83 (m, 3H), 3.75 (m, 3H), 1.90 (m, 3H)。
- 656 δ 9.50 (m, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.50 (m, 1H), 5.00 (m, 2H), 4.09 (d, 2H), 2.00 (m, 1H), 0.98 (d, 4H), 0.89 (d, 2H) (E與Z異構體之2:1混合物)。
- 657 δ 9.50 (d, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.50 (t, 1H), 5.00 (m, 2H), 1.38 (s, 9H) (單一異構體)。
- 658 δ 9.50 (m, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.50 (m, 1H), 5.00 (m, 2H), 4.00 (s, 2H), 0.99 (s, 6H), 0.89 (s, 3H) (E與Z異構體之2:1混合物)。

- 659 δ 9.50 (m, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.50 (m, 1H), 5.00 (m, 2H), 4.82 (s, 0.66H), 4.76 (s, 1.34H), 4.22 (q, 0.66H), 4.20 (q, 1.34H), 1.29 (t, 1H), 1.27 (t, 2H) (E與Z異構體之2:1混合物)。
- 686 δ (丙酮-d₆) 8.77 (br s, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.74 (t, 1H), 7.73-7.00 (m, 8H), 5.62 (s, 2H)。
- 700 δ 9.44 (d, 1H), 8.22 (t, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.42 (t, 1H), 5.55 (br s, 2H), 4.42 (q, 2H), 1.04 (t, 3H)。
- 701 δ 9.44 (d, 1H), 8.26 (t, 1H), 7.91 (d, 2H), 7.65 (s, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.55 (t, 1H), 7.44 (m, 3H), 5.56 (br s, 2H)。

a ¹H NMR數據係以自四甲基矽烷之低場ppm計。除非另外指示，否則為CDCl₃溶液；「丙酮-d₆」為CD₃C(=O)CD₃。偶合係由(s)-單峰、(d)-二重峰、(t)-三重峰、(m)-多重峰、(dd)-雙二重峰、(ddd)-雙二重峰之雙重峰、(dt)-雙三重峰、(td)-三二重峰、(br)寬峰指示。

b R²為CH₂CF₃之化合物之¹H NMR譜通常不展示對應於CH₂CF₃質子之峰。

以下測試證明本發明之化合物對特定害蟲之控制功效。「控制功效」表示對無脊椎害蟲發展之抑制(包括致死)，其使得攝食顯著減少。然而，由該等化合物提供之害蟲控制保護作用並不限於該等物種。關於化合物描述參見索引表A-F。

本發明之生物實例

測試A

為評估對菱紋背蛾(小菜蛾)之控制，測試單元由內部有12-14天大之蘿蔔植物之小開口容器組成。將測試單元用約50隻幼蟲預先侵染，經由玉米棒屑使用火箭筒式接種器將該等幼蟲施配至測試單元中。在施配至測試單元後，幼

蟲移動至測試植物上。

使用含有10%丙酮、90%水及300 ppm含有烷基芳基聚氧化乙烯、游離脂肪酸、乙二醇及異丙醇之X-77® Spreader Lo-Foam Formula 非離子型界面活性劑 (Loveland Industries, Inc. Greeley, Colorado, USA)之溶液調配測試化合物。經由定位於每一測試單元頂部上方1.27 cm(0.5吋)處之具有1/8 JJ定製體之SUJ2霧化器噴嘴 (Spraying Systems Co. Wheaton, Illinois, USA)以1 mL液體施用經調配之化合物。將測試化合物以250 ppm噴霧且重複三次。噴霧經調配之測試化合物之後，使每一測試單元乾燥1 h且隨後將一黑色濾篩蓋置於其上。將測試單元保持在25°C及70%相對濕度下之生長腔室中6天。接著基於所消耗的葉枝視覺上評估植物攝食破壞。

在所測試之式1化合物中，以下化合物提供極佳至優良程度之控制功效(40%或更少攝食破壞及/或100%死亡率)：

1、2、3、5、6、7、8、9、10、12、13、14、15、16、17、18、19、20、22、23、24、25、26、27、32、33、37、39、40、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、67、68、70、72、73、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、87、88、89、90、91、92、93、95、97、98、100、101、102、103、104、106、107、108、109、120、121、122、123、128、135、136、137、138、139、140、141、145、146、

147、148、149、150、152、153、154、155、156、159、
161、162、164、166、167、168、169、170、173、178、
179、180、185、186、187、188、189、190、192、193、
196、197、198、199、200、201、202、203、205、206、
207、208、209、210、211、212、215、216、217、218、
219、220、221、222、226、227、229、232、235、236、
237、240、242、243、245、246、247、248、252、253、
254、255、256、257、259、261、262、263、264、266、
267、270、271、272、273、274、275、276、277、278、
279、281、282、284、286、287、288、289、290、291、
293、294、295、297、298、299、300、301、302、307、
310、311、312、313、314、319、321、323、324、327、
330、332、339、340、341、342、343、347、350、351、
352、353、355、359、361、362、363、364、366、367、
370、371、372、374、377、379、380、386、389、391、
400、401、405、406、412、414、418、421、422、424、
426、427、431、436、438、440、441、446、459、460、
461、463、469、470、471、472、473、474、475、476、
477、478、479、480、481、482、483、484、485、486、
487、488、489、490、491、492、493、494、495、496、
498、499、500、501、502、503、511、515、524、525、
527、528、529、530、531、532、534、536、537、539、
540、541、542、544、545、546、548、549、550、551、
557、562、563、566、567、575、581、582、589、596、

597、598、600、603、608及609。

測試B

為評估對秋天行軍蟲(草地貪夜蛾)之控制，測試單元由內部有4-5天大之玉蜀黍(玉米)植物之小開口容器組成。將測試單元用一塊昆蟲食料上之10-15隻1天大之幼蟲預侵染(使用核心取樣器)。

如針對測試A所述，調配測試化合物且將其以250 ppm噴霧。重複施用三次。噴霧之後，將測試單元維持在25°C及70%相對濕度下之生長腔室中且隨後如針對測試A所述進行視覺上評估。

在所測試之式1化合物中，以下化合物提供極佳至優良程度之控制功效(40%或更少攝食破壞及/或100%死亡率)：
1、3、8、15、18、22、40、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、53、54、55、56、58、59、60、62、65、66、68、70、73、74、75、76、79、81、83、84、92、93、95、103、123、141、145、166、168、169、173、179、180、185、186、187、188、189、192、193、196、200、215、217、226、232、240、242、245、252、253、254、255、256、261、270、272、275、276、277、310、312、372、418、427、436、440、451、461、473、475、476、477、478、479、480、481、482、484、486、489、490、491、493、495、496、498、499、500、501、502、524、525、530、531、534、540、541、542、544、549、550、574、598及609。

測試C

為評估經由接觸及/或系統性方式對綠桃蚜(桃蚜)之控制，測試單元由內部有12-15天大之蘿蔔植物之小開口容器組成。藉由將自培養植物切取之葉片上的30-40隻蚜蟲置放於測試植物之葉上來預侵染測試單元(切葉法)。隨著葉片變乾，蚜蟲移動至測試植物上。在預侵染後，以一層砂覆蓋測試單元之土壤。

如針對測試A所述，調配測試化合物且將其以250 ppm噴霧。重複施用三次。噴霧經調配之測試化合物之後，使每一測試單元乾燥1 h且隨後將一黑色濾篩蓋置於其上。將測試單元保持在19-21°C及50-70%相對濕度下之生長腔室中6天。隨後視覺上評估每一測試單元之昆蟲死亡率。

在所測試之式1化合物中，以下化合物引起至少80%之死亡率：5、10、19、29、30、31、42、43、44、49、50、53、57、59、60、63、64、65、66、68、71、72、74、75、77、78、79、80、82、83、87、94、99、100、101、102、105、108、109、111、118、119、120、123、139、140、151、153、157、166、171、172、173、178、180、185、192、193、196、197、198、200、203、207、213、214、216、218、220、224、231、232、238、256、277、357、365、373、389、390、394、396、397、404、407、411、422、437、443、444、445、463、464、469、471、472、476、477、481、482、483、486、491、492、493、495、496、498、499、500、501、503、513、530、

531、536、537、540、544、549、550、575、577、590、593、597、598、600或608。

測試D

為評估經由接觸及/或系統性方式對棉瓜蚜(棉蚜)之控制，測試單元由內部有6-7天大之棉花植物之小開口容器組成。根據針對測試C所述之切葉法，用葉片上之30-40隻昆蟲預侵染測試單元，且以一層砂覆蓋測試單元之土壤。

如針對測試C所述，調配測試化合物且將其以250 ppm噴霧。重複施用三次。噴霧之後，將測試單元維持在生長腔室中且隨後如針對測試C所述進行視覺上評估。

在所測試之式1化合物中，以下化合物引起至少80%之死亡率：5、10、30、31、49、54、66、75、87、94、95、166、167、192、193、198、204、210、213、214、220、230、231、235、238、264、277、486、490、540、544及550。

測試E

為評估經由接觸及/或系統性方式對玉米飛虱(玉米花翅飛虱)之控制，測試單元由內部有3-4天大之玉蜀黍植物(穗)之小開口容器組成。在施用之前將白砂添加至土壤上。如針對測試A所述，調配測試化合物且將其以250 ppm及50 ppm噴霧且重複三次。噴霧之後，使測試單元乾燥1 h，接著用約15-20隻若蟲(18至21天大)對其進行後期侵染，此係藉由用鹽振盪器(salt shaker)將若蟲噴灑至砂子上來進行。將黑色濾篩蓋置放於圓筒上。將測試單元保持在

22-24°C及50-70%相對濕度下之生長腔室中6天。隨後視覺上評估每一測試單元之昆蟲死亡率。

在以250 ppm測試之式1化合物中，以下化合物引起至少80%之死亡率：1、2、3、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、21、22、23、24、25、26、27、29、30、31、32、34、35、36、37、38、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、67、68、70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、87、88、89、90、91、93、94、95、96、97、98、99、100、101、103、104、105、106、107、108、109、111、114、115、116、118、119、120、121、122、123、161、162、163、237、278、279、281、282、283、284、285、289、290、291、292、293、294、295、296、297、298、299、301、302、304、306、308、309、314、317、318、319、320、321、322、323、324、325、327、329、330、336、340、341、343、344、345、346、347、348、349、350、351、352、353、356、357、358、359、360、361、362、363、364、365、366、368、375、376、377、378、384、386、389、390、392、393、394、396、397、399、400、402、403、404、406、407、408、409、411、412、413、414、415、416、419、420、421、422、423、424、425、426、428、431、433、435、436、437、438、441、442、443、

444、445、446、447、449、450、459、460、461、462、
463、464、465、466、467、468、469、470、471、472、
474、475、476、477、479、481、482、483、484、485、
519、556、562、564、568、570、571、573、574、575、
576、577、579、582、583、584、586、587、588、590、
591、592、593、594、604及606。

在以 50 ppm 測試之式 1 化合物中，以下化合物提供極佳
至優良程度之控制功效(80%或更高死亡率)：1、2、3、
5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、16、17、18、
19、21、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32、
36、38、39、40、42、43、44、45、46、47、48、49、
50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、
62、63、64、65、66、67、68、70、71、72、73、74、
75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、
87、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、
99、100、101、102、103、104、105、107、108、109、
111、118、119、120、121、123、124、125、134、136、
137、138、139、140、141、146、147、148、149、150、
151、154、156、157、161、166、167、168、171、172、
173、180、185、192、193、196、197、198、199、200、
201、202、203、204、207、208、209、210、212、213、
214、215、216、217、218、219、220、221、222、223、
224、225、226、229、230、231、232、233、234、235、
236、237、238、239、240、241、243、244、245、246、

247、248、249、252、254、255、256、257、259、260、
262、264、266、278、280、284、289、290、291、292、
293、295、297、301、304、314、318、319、320、321、
323、324、325、327、330、343、344、345、346、347、
348、349、350、351、352、357、359、360、361、362、
363、365、376、377、378、390、392、393、394、399、
400、403、404、408、411、412、413、414、419、420、
421、422、423、424、425、426、431、433、435、436、
437、438、441、442、443、444、446、448、449、450、
456、459、460、461、462、463、464、466、468、469、
470、471、472、473、474、475、476、477、481、482、
483、485、486、487、488、489、490、491、492、493、
495、496、497、498、499、500、501、502、503、511、
513、514、522、523、524、525、527、530、531、536、
537、539、540、542、544、546、547、570、571、573、
574、575、576、577、579、584、586、587、588、591、
592、593、597、598、599、600及604。

測試F

為評估經由接觸及/或系統性方式之對馬鈴薯葉蟬(馬鈴薯小綠葉蟬)之控制，測試單元由內部有5-6天大之Soleil豆植物(長出初生葉)之小開口容器組成。將白砂添加至土壤上且在施用之前切除一片初生葉。

如針對測試A所述，調配測試化合物且將其以250及50 ppm噴霧且重複測試三次。噴霧之後，使測試單元乾燥1

h, 接著用5隻馬鈴薯葉蟬(18至21天大之成蟲)對其後期侵染。將黑色濾篩蓋置放於圓筒上。將測試單元保持在24°C及70%相對濕度下之生長腔室中6天。隨後視覺上評估每一測試單元之昆蟲死亡率。

在以250 ppm測試之式1化合物中, 以下化合物提供極佳至優良程度之控制功效(80%或更高死亡率): 1、2、3、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、16、17、18、19、21、23、24、25、26、27、29、30、31、36、37、38、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、67、68、70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、86、87、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、99、100、101、102、104、105、106、108、109、111、113、116、117、118、120、123、278、279、281、283、285、286、288、289、311、324、363、400、406、419、422、444、445、459、461、463、469、470、473、474、475、476、477、478、479、480、481、482、484、574、581、608及609。

在以50 ppm測試之式1化合物中, 以下化合物提供極佳至優良程度之控制功效(80%或更高死亡率): 1、2、3、5、6、7、9、10、11、12、13、14、16、17、19、21、23、24、25、26、27、29、30、31、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、

56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、67、68、
70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、80、81、
82、83、84、85、86、87、88、89、90、91、92、93、
94、95、96、97、98、99、100、101、102、104、105、
106、108、109、111、118、119、120、123、124、136、
137、138、139、140、141、146、147、151、153、155、
156、157、160、166、167、168、171、172、173、178、
180、185、186、189、192、193、194、196、197、198、
199、200、201、202、203、204、207、208、209、210、
211、212、213、214、215、216、217、218、219、220、
222、223、224、225、226、232、233、235、236、237、
238、240、243、244、245、246、247、252、254、255、
256、258、259、260、261、262、264、266、273、274、
277、280、318、324、327、330、340、341、357、359、
361、362、363、364、369、374、377、381、389、390、
392、394、396、397、399、403、404、407、408、411、
416、417、423、424、431、433、435、437、449、460、
461、462、463、464、466、467、469、470、471、472、
473、474、475、476、477、479、480、481、482、483、
486、487、488、489、490、491、492、493、494、495、
496、497、498、500、501、502、503、514、515、524、
525、530、531、534、536、537、539、540、541、542、
544、545、551、570、575、591、597、598、600、608及
609。

測試 G

為評估經由接觸及/或系統性方式對西方花薊馬(西方花薊馬)之控制，測試單元由內部有5-7天大之Soleil豆植物之小開口容器組成。

如針對測試A所述，調配測試化合物且將其以250 ppm噴霧且重複三次。噴霧之後，使測試單元乾燥1小時且接著將22-27隻薊馬成蟲添加至單元中且接著將黑色濾篩蓋置放於上方。將測試單元保持在25°C及45-55%相對濕度下7天。

在所測試之式1化合物中，以下化合物提供極佳至優良程度之控制功效(30%或更少植物破壞及/或100%死亡率)：158、211、212、229、235、257、258、262、273、497、528、531、544、549及579。

測試 H

為評估對貓蚤(貓櫛頭蚤)之控制，將測試化合物溶解於丙二醇/甘油縮甲醛(60:40)中且接著在牛血中稀釋至30 ppm之最終測試率。將經處理之血液置放於管底部經膜覆蓋之管中。使約10隻貓蚤成蟲經由膜食取經處理之血液。72 h後，評估跳蚤成蟲之死亡率。

在所測試之式1化合物中，以下化合物引起50%或更高死亡率：1、2、3、5、6、8、9、10、12、14、16、17、19、21、26、29、34、36、37、38、39、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、52、53、54、55、56、57、58、59、61、62、65、66、71、72、75、76、78、

81、82、83、88、90、92、98、100、101、103、104、
105、106、107、114、118、119、120、121、123、124、
125、134、135、136、137、138、149、150、153、154、
155、156、157、161、166、167、169、172、179、186、
188、189、190、191、192、193、196、199、203、204、
206、207、208、210、211、216、217、218、219、223、
224、225、230、280、281、289、290、294、295、301、
312、314、318、319、323、324、327、331、343、346、
348、350、360、361、362、363、364、369、371、372、
373、374、378、382、383、385、389、391、393、406、
411、420、421、422、423、431、435、438、440、461、
466、468、469、470、471、473、475、476、477、478、
479、480、490、491、492、493、494、495、496、497、
498、500、503、511、513、521、528、589、590、592、
596、597、599、604及606。

測試 I

為評估對貓蚤(貓櫛頭蚤)之控制，將測試化合物溶解於丙酮:水(75:25)中至500 ppm之最終測試率。接著將20 μ L之500 ppm溶液施用於管底部之濾紙。使管乾燥3小時。接著將約10隻跳蚤成蟲添加至管中，且將管加蓋。48小時後，評估跳蚤之死亡率。

在所測試之式1化合物中，以下化合物引起50%或更高死亡率：5、6、10、12、19、21、22、23、26、27、28、38、39、40、41、42、43、44、45、47、48、50、54、

56、57、59、61、62、63、65、70、71、72、75、81、82、83、102、107、108、114、115、121、124、136、138、141、151、154、161、166、173、186、193、196、197、203、204、208、211、216、218、224、229、232、281、290、291、295、301、310、321、343、350、353、357、360、361、364、408、419、424、437、446、450、461、464、466、468、470、471、474、476、483、485、487、490、491、492、493、494、496、498、501、507、520、521、576、597及599。

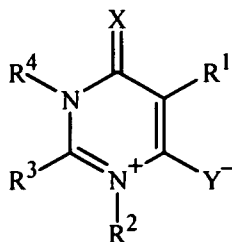
測試J

為評估在向小鼠經口投與測試化合物之後對貓蚤(貓櫛頭蚤)之控制，向CD-1[®]小鼠(約30 g，雄性，獲自Charles River Laboratories, Wilmington, MA)經口給與10 mg/kg之量的溶解於丙二醇/甘油縮甲醛(60:40)中之測試化合物。經口投與測試化合物2小時後，將約8至16隻跳蚤成蟲施加至各小鼠。接著在跳蚤施加至小鼠48小時後，評估跳蚤之死亡率。

在所測試之式1化合物中，以下化合物引起20%或更高死亡率：2、10、19、41、42、43、44、45、46、47、51、56、57、59、61、63、72、75、80、81、82、83、88、92、96、101、104、105、106、107、111、119、120、121、123、124、136、137、140、148、151、154、169、186、319、461、475、476、477、493、497、498、588及599。

七、申請專利範圍：

1. 一種式1化合物，



1

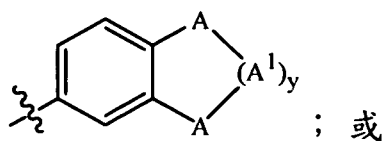
其中

X為O；

Y為O；

R¹為苯基、萘基或5或6員雜芳環，各視情況經1至3個

獨立選自由以下組成之群之取代基取代：鹵素、
 氰基、硝基、C₁-C₄烷基、C₂-C₄烯基、C₂-C₄炔
 基、C₁-C₄鹵烷基、C₂-C₄鹵烯基、C₂-C₄烷基羰
 基、C₂-C₄鹵烷基羰基、C₂-C₄烷氧基羰基、C₂-C₄
 烷基胺基羰基、C₃-C₇二烷基胺基羰基、
 C(O)N(-CH₂Z²CH₂-)、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧
 基、C₂-C₆烷氧基烷基、S(O)_nR¹²、S(O)₂R¹³、C₁-
 C₄烷基胺基、C₂-C₆二烷基胺基、SF₅、Si(CH₃)₃、
 CHO、羥基、OC(O)R¹⁹及N(R²⁰)C(O)R¹⁹；或

R¹為

R¹為8至10員雜芳族雙環系統，視情況在碳環成員上
 經多至3個獨立選自由以下組成之群之取代基取

代：鹵素、氰基、硝基、 SF_5 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 炔基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 鹵烷基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷氧基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基胺基羰基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 二烷基胺基羰基、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{---CH}_2\text{Z}^2\text{CH}_2\text{---})$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷氧基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 烷氧基烷基、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{12}$ 、 $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基胺基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 二烷基胺基、 $\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ 、 CHO 、羥基、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{19}$ 及 $\text{N}(\text{R}^{20})\text{C}(\text{O})\text{R}^{19}$ ，視情況在氮環成員上另經甲基取代；或

R^1 為苯基或5或6員雜芳環，各經 GQ^1 取代，各視情況經1個 Q^2 取代，且各視情況另經1或2個獨立選自由以下組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 SF_5 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 炔基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 鹵烷基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷氧基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基胺基羰基、 $\text{C}_3\text{-C}_7$ 二烷基胺基羰基、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{---CH}_2\text{Z}^2\text{CH}_2\text{---})$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷氧基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 烷氧基烷基、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{12}$ 、 $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基胺基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 二烷基胺基、 $\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ 、 CHO 、羥基、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{19}$ 及 $\text{N}(\text{R}^{20})\text{C}(\text{O})\text{R}^{19}$ ；或

R^1 為苯基或5或6員雜芳環，各經 LQ^1 取代，且視情況經1或2個獨立選自由以下組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 炔基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$

鹵烷基羰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_2-C_4 烷基胺基羰基、 C_3-C_7 二烷基胺基羰基、 $C(O)N(-CH_2Z^2CH_2-)$ 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 $S(O)_2R^{13}$ 、 C_1-C_4 烷基胺基、及 C_2-C_6 二烷基胺基；

各 A 獨立地為 $C(R^{16})_2$ 、O、 $S(O)_n$ 或 NR^{15} ；

各 A^1 獨立地為 $C(R^{17})_2$ ；

G 為一直接鍵；

L 為苯基或 5 或 6 員雜芳環，視情況經 1 或 2 個獨立選自由以下組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_4 鹵烷基羰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_2-C_4 烷基胺基羰基、 C_3-C_7 二烷基胺基羰基、 $C(O)N(-CH_2Z^2CH_2-)$ 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 $S(O)_2R^{13}$ 、 C_1-C_4 烷基胺基、及 C_2-C_6 二烷基胺基；

Q^1 為苯基或 5 或 6 員雜芳環，各視情況經 1 至 3 個獨立選自由以下組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_4 鹵烷基羰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_2-C_4 烷基胺基羰基、 C_3-C_7 二烷基胺基羰基、 $C(O)N(-CH_2Z^2CH_2-)$ 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 $S(O)_2R^{13}$ 、 C_1-C_4 烷基胺基、 C_2-C_6 二烷基胺基、

SF_5 、 $Si(CH_3)_3$ 、 CHO 、羥基、 $OC(O)R^{19}$ 及
 $N(R^{20})C(O)R^{19}$ ；

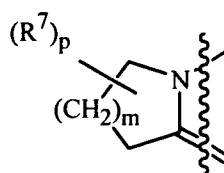
Q^2 為苯基或 5 或 6 員雜芳環，各視情況經 1 至 2 個獨立選
 自由以下組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、
 硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4
 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4
 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺
 基羰基、 $C(O)N-(CH_2Z^2CH_2)-$ 、 C_1 - C_4 烷氧基、
 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、
 $S(O)_2R^{13}$ 、 C_1 - C_4 烷基胺基、及 C_2 - C_6 二烷基胺基；

R^2 為 C_2 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、或 $CR^5R^6CH_2OR^{21}$ ；

R^3 為 C_1 - C_6 烷基、或 C_1 - C_6 鹵烷基；

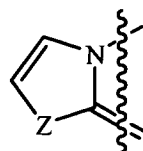
R^4 為 C_1 - C_6 烷基、或 C_1 - C_6 鹵烷基；或

R^3 及 R^4 與相鄰連接之氮及碳原子一起形成視情況經取
 代之環 R-1



R-1

或環 R-2



R-2 ;

Z 為 $C(R^{8a})=C(R^{8b})$ 、S、O 或 NCH_3 ，其限制條件是該

$C(R^{8a})=C(R^{8b})$ 基團經取向以使鍵結於 R^{8b} 之碳原子用以連結而作為式 1 中的 R^3 ；

各 R^5 獨立地為 H、F、Cl、氰基或 C_1 - C_4 烷基；

各 R^6 獨立地為 H、F、Cl 或 CH_3 ；

各 R^7 獨立地為 H、鹵素、氰基、 CF_3 、 C_1 - C_3 烷基或 C_3 - C_6 環烷基；

R^{8a} 為 H 或 F；

R^{8b} 為 H、F、 CF_2H 、或 CF_3 ；

各 R^{12} 獨立地為 C_1 - C_4 烷基或 C_1 - C_4 鹵烷基；

各 R^{13} 獨立地為 C_1 - C_4 烷基胺基、 C_2 - C_6 二烷基胺基或 $N(-CH_2Z^2CH_2-)$ ；

各 R^{15} 獨立地為 C_1 - C_4 烷基；

各 R^{16} 獨立地為 H 或 C_1 - C_4 烷基；

各 R^{17} 獨立地為 H、F 或 CH_3 ；

各 R^{19} 獨立地為 C_1 - C_4 烷基；

各 R^{20} 獨立地為 H 或 C_1 - C_4 烷基；

R^{21} 為 H 或 C_1 - C_4 烷基；

m 為 0、1、2 或 3；

各 n 獨立地為 0、1 或 2；

p 為 0、1、2、3 或 4；

y 為 1 或 2；及

各 Z^2 獨立地為 CH_2CH_2 、 $CH_2CH_2CH_2$ 或 CH_2OCH_2 ；

其限制條件為當 R^1 為未經取代之苯基， R^3 與 R^4 一起形成環 R-2，Z 為 S，X 為 O 且 Y 為 O 時， R^2 不為 C_3 - C_4

烷氧基烷基。

2. 如請求項 1 之化合物，其中

R^1 為苯基或 6 員雜芳環，各視情況經 1 至 3 個獨立選自由以下組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 鹵烯基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰基、 $C(O)N-(CH_2Z^2CH_2)-$ 、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 $S(O)_2R^{13}$ 、 C_1 - C_4 烷基胺基、 C_2 - C_6 二烷基胺基、 SF_5 、 $Si(CH_3)_3$ 、 CHO 、羥基、 $OC(O)R^{19}$ 及 $N(R^{20})C(O)R^{19}$ ；或

R^1 為苯基或 5 或 6 員雜芳環，各經 GQ^1 取代，各視情況經 1 個 Q^2 取代，且各視情況另經 1 或 2 個獨立選自由以下組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 SF_5 、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰基、 $C(O)N-(CH_2Z^2CH_2)-$ 、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 $S(O)_2R^{13}$ 、 C_1 - C_4 烷基胺基、 C_2 - C_6 二烷基胺基、 $Si(CH_3)_3$ 、 CHO 、羥基、 $OC(O)R^{19}$ 及 $N(R^{20})C(O)R^{19}$ 。

3. 如請求項 2 之化合物，其中

R^3 為 C_1 - C_6 烷基或 C_1 - C_6 鹵烷基；及

R^4 為 C_1-C_6 烷基或 C_1-C_6 鹵烷基。

4. 如請求項 2 之化合物，其中

R^3 及 R^4 與相鄰連接之氮及碳原子一起形成視情況經取代之環 R-2；及

Z 為 $CH=CH$ 或 $CH=CF$ ，其中該 $CH=CF$ 基團經取向以使鍵結於 F 之碳原子用以連結而作為式 1 中的 R^3 。

5. 如請求項 2 之化合物，其中

R^3 及 R^4 與相鄰連接之氮及碳原子一起形成視情況經取代之環 R-2；及

Z 為 S。

6. 如請求項 3 至 5 中任一項之化合物，其中

R^1 為苯基或吡啶基，各視情況經 1 至 3 個獨立選自由以下組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4 鹵烯基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_4 鹵烷基羰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_2-C_4 烷基胺基羰基、 C_3-C_7 二烷基胺基羰基、 $C(O)N-(CH_2Z^2CH_2)-$ 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 $S(O)_2R^{13}$ 、 C_1-C_4 烷基胺基、 C_2-C_6 二烷基胺基、 SF_5 、 $Si(CH_3)_3$ 、 CHO 、羥基、 $OC(O)R^{19}$ 及 $N(R^{20})C(O)R^{19}$ 。

7. 如請求項 3 至 5 中任一項之化合物，其中

R^1 為苯基或吡啶基，各經 GQ^1 取代，視情況另經 1 或 2 個獨立選自由以下組成之群之取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 SF_5 、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔

基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_4 烷基胺基羰基、 C_3 - C_7 二烷基胺基羰基、 $C(O)N(-CH_2Z^2CH_2-)$ 、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 $S(O)_nR^{12}$ 、 $S(O)_2R^{13}$ 、 C_1 - C_4 烷基胺基、 C_2 - C_6 二烷基胺基、 $Si(CH_3)_3$ 、 CHO 、羰基、 $OC(O)R^{19}$ 及 $N(R^{20})C(O)R^{19}$ 。

8. 如請求項 3 至 5 中任一項之化合物，其中
 R^5 為 H 或甲基；
 R^6 為 H。
9. 如請求項 1 之化合物，其係選自由以下組成之群：
 3-(2,4-二氟苯基)-2-羰基-4-側氧基(oxo)-1-(2,2,2-三氟乙基)-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘓啶鎗(pyrimidinium)內鹽；
 3-(4-氟苯基)-2-羰基-4-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘓啶鎗內鹽；及
 2-羰基-4-側氧基-3-苯基-1-(2,2,2-三氟乙基)-4*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘓啶鎗內鹽。
10. 一種組合物，其包含如請求項 1 至 9 中任一項之化合物及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑及液體稀釋劑組成之群之其他組份，該組合物視情況進一步包含至少一種其他生物學活性化合物或藥劑。
11. 如請求項 10 之組合物，其中該至少一種其他生物學活性化合物或藥劑係選自由以下組成之群：阿巴汀(abamectin)、歐殺松(acephate)、亞醜蟎(acequinocyl)、啞蟲

脒 (acetamiprid)、阿納寧 (acrinathrin)、醯胺氟美 (amidoflumet)、三亞蟎 (amitraz)、阿維菌素 (avermectin)、印楝素 (azadirachtin)、穀硫磷 (azinphosmethyl)、畢芬寧 (bifenthrin)、聯苯胼酯 (bifenazate)、雙三氟蟲脒 (bistrifluron)、硼酸鹽、3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氯基-2-甲基-6-[(甲基胺基)羰基]苯基]-1H-吡唑-5-甲醯胺、布芬淨 (buprofezin)、硫線磷 (cadusafos)、加保利 (carbaryl)、加保扶 (carbofuran)、殺螟丹 (cartap)、伐蟲脒 (carzol)、氯蟲醯胺 (chlorantraniliprole)、蟲蟎脒 (chlorfenapyr)、克福隆 (chlorfluazuron)、毒死蜱 (chlorpyrifos)、甲基毒死蜱 (chlorpyrifos-methyl)、環蟲醯脒 (chromafenozide)、殺蟎錫 (clofentezin)、可尼丁 (clothianidin)、噻氟美芬 (cyflumetofen)、賽扶寧 (cyfluthrin)、 β -賽扶寧、賽洛寧 (cyhalothrin)、 γ -賽洛寧、 λ -賽洛寧、賽滅寧 (cypermethrin)、 α -賽滅寧、 ζ -賽滅寧、賽滅淨 (cyromazine)、溴氟菊酯 (deltamethrin)、汰芬隆 (diafenthiuron)、大利松 (diazinon)、狄氏劑 (dieldrin)、二福隆 (diflubenzuron)、四氟甲醚菊酯 (dimefluthrin)、殺蟲雙 (dimehypo)、大滅松 (dimethoate)、味蟲胺 (dinotefuran)、戴芬蘭 (diofenolan)、因滅汀 (emamectin)、硫丹 (endosulfan)、益化利 (esfenvalerate)、乙蟲清 (ethiprole)、依芬寧 (etofenprox)、乙蟎唑 (etoxazole)、苯丁錫 (fenbutatin oxide)、芬硫克 (fenothiocarb)、芬諾克 (fenoxycarb)、芬

普寧 (fenpro-pathrin)、芬化利 (fenvalerate)、氟蟲腈 (fipronil)、氟尼胺 (flonicamid)、氟苯地胺 (flubendiamide)、護賽寧 (flucythrinate)、氟芬林 (flufenerim)、氟芬隆 (flufen-oxuron)、氟胺氟戊菊酯 (fluvalinate)、氟胺氟菊酯 (tau-fluvalinate)、大福松 (fonophos)、複滅蟎 (formetanate)、福賽絕 (fosthiazate)、氟蟲醯肼 (halofenozide)、六伏隆 (hexaflumuron)、噻蟎酮 (hexythiazox)、伏蟻脞 (hydramethylnon)、益達胺 (imidacloprid)、節蟲威 (indoxacarb)、殺昆蟲皂、亞芬松 (isofenphos)、祿芬隆 (lufenuron)、馬拉硫磷 (malathion)、美氟脞 (metaflumizone)、聚乙醛 (metaldehyde)、甲胺磷 (methamidophos)、殺撲磷 (methidathion)、滅賜克 (methiodicarb)、滅多蟲 (methomyl)、美賜年 (methoprene)、甲氧氯 (methoxychlor)、甲氧苄氟菊酯 (metofluthrin)、久效磷 (monocrotophos)、甲氧蟲醯肼 (methoxyfenozide)、吡蟲胺 (nitenpyram)、硝基亞嗪 (nithiazine)、諾華隆 (novaluron)、紐伏隆 (noviflumuron)、歐殺滅 (oxamyl)、對硫磷 (parathion)、甲基對硫磷、百滅寧 (permethrin)、甲拌磷 (phorate)、伏殺磷 (phosalone)、益滅松 (phosmet)、福賜米松 (phosphamidon)、抗蚜威 (pirimicarb)、丙溴磷 (profenofos)、丙氟菊酯 (profluthrin)、克蟎特 (propargite)、丙苯煙菊酯 (protrifenbute)、派滅淨

(pymetrozine)、吡拉氟普(pyrafluprole)、除蟲菊酯(pyrethrin)、噁蟎靈(pyridaben)、啞蟲丙醚(pyridalyl)、吡啶喹啉(pyrifluquinazon)、吡瑞普(pyriprole)、百利普芬(pyriproxyfen)、魚藤酮(rotenone)、尼魚丁(ryanodine)、斯平托姆(spinetoram)、賜諾殺(spinosad)、螺蟎酯(spirodiclofen)、螺甲蟎酯(spiromesifen)、螺蟲乙酯(spirotetramat)、硫丙磷(sulprofos)、蟲醯肼(tebufenozide)、吡蟎胺(tebufenpyrad)、得福隆(teflubenzuron)、七氟菊酯(tefluthrin)、託福松(terbufos)、殺蟲威(tetrachlorvinphos)、胺菊酯(tetramethrin)、噻蟲啉(thiacloprid)、噻蟲嗪(thiamethoxam)、硫雙威(thiodicarb)、殺蟲雙(thiosultapodium)、啞蟲醯胺(tolfenpyrad)、四溴菊酯(tralomethrin)、啞蚜威(triazamate)、三氯松(trichlorfon)、殺蟲隆(triflumuron)、蘇雲金芽孢桿菌(*Bacillus thuringiensis*) δ -內毒素、昆蟲病原(entomopathogenic)細菌、昆蟲病原病毒及昆蟲病原真菌。

12. 一種用於保護動物免遭無脊椎寄生害蟲侵襲之組合物，其包含殺寄生蟲有效量之如請求項1至9中任一項之化合物及至少一種載劑。
13. 一種用於控制無脊椎害蟲之方法，其包含使該無脊椎害蟲或其環境與生物學有效量之如請求項1至9中任一項之化合物接觸。
14. 一種處理種子的方法，其包含以如請求項1至9中任一項

之化合物處理一種子，其中前述化合物的量為處理前種子之約 0.0001 重量% 至 1 重量%。