

(此處由本局於收
文時黏貼條碼)

發明專利說明書

公告本

(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：F6108514

C07C>33/64 (2006.01)

※申請日期：P63.13

※IPC 分類：

C07D>3/82 (2006.01)

A01N 43/10 (2006.01)

A01N 43/40 (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物及含該衍生物之蟲害防治劑
N-2-(HETERO)ARYLETHYLCARBOXAMIDE DERIVATIVE AND PEST CONTROLLING
AGENT CONTAINING THE SAME

A01N 43/56 (2006.01)

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

日本農藥股份有限公司

NIHON NOHYAKU CO., LTD.

代表人：(中文/英文)(簽章) 大內脩吉 / OHUCHI, SHUKICHI

住居所或營業所地址：(中文/英文)

日本國東京都中央區日本橋1丁目2番5號

2-5, Nihonbashi 1-chome, Chuo-ku, Tokyo, Japan

國籍：(中文/英文) 日本國/JAPAN

三、發明人：(共 8 人)

姓名：(中文/英文)

1. 織田雅次 / ODA, MASATSUGU

2. 松崎義廣(松崎義広) / MATSUZAKI, YOSHIHIRO

3. 田中浩二 / TANAKA, KOJI

4. 瀧澤英二(滝澤英二) / TAKIZAWA, EIJI

5. 長谷部元宏 / HASEBE, MOTOHIRO

6. 黒木信孝 / KUROKI, NOBUTAKA

7. 諏訪明之 / SUWA, AKIYUKI

8. 大島賢治 / OSHIMA, KENJI

國籍：(中文/英文) 1. 至 8. 日本國/JAPAN

四、聲明事項：

主張專利法第二十二條第二項 第一款或 第二款規定之事實，其事實發生日期為： 年 月 日。

申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1. 日本國 2006 年 03 月 20 日 特願 2006-077752（主張優先權）
2. 日本國 2006 年 10 月 30 日 特願 2006-294810（主張優先權）

無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

主張專利法第三十條生物材料：

須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

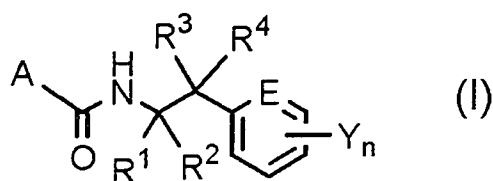
國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

五、中文發明摘要：

一種式(I)所示之N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物及其鹽類：



其中，

R^1 和 R^2 各自獨立為氫原子等；

R^3 和 R^4 各自獨立為氫原子等；

每個 Y 各自獨立為鹵原子、視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)

烷基等；

n 為 1 至 5 的整數；

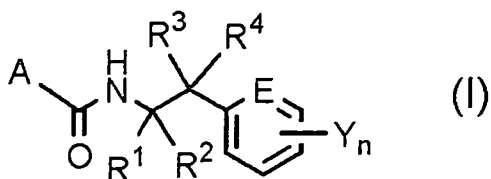
A 為特定經取代之環狀基；

E 為 C-H、C-Y(Y 為上述定義者)或氮原子，且

含該衍生物或其鹽類作為活性成分之蟲害防治劑顯示出
 比起先前技術更優異之性能，而且該蟲害防治劑特別適用作於
 低劑量下具寬廣防治範圍之植物疾病防治劑或殺線蟲劑。

六、英文發明摘要：

An N-2-(hetero)arylethylcarboxamide derivative represented by the formula (I)



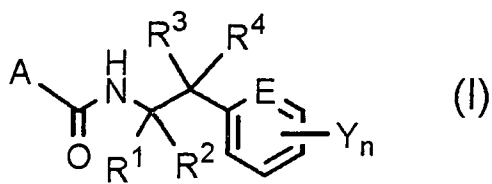
wherein R^1 and R^2 are each independently a hydrogen atom etc., R^3 and R^4 are each independently a hydrogen atom etc., each Y is independently a halogen atom; a (C_1 - C_6)alkyl group optionally substituted by halogen atom(s) etc., n is an integer of 1 to 5, A is a specific substituted cyclic group, E is C-H; C-Y (Y is as defined above); or a nitrogen atom, a salt thereof, and a pest controlling agent containing the derivative or salt as an active ingredient show superior performance as compared to the prior art technique, and are useful particularly as plant disease controlling agents or nematocides having a broad control spectrum at a low dose.

七、指定代表圖：本案無圖式

(一)本案指定代表圖為：第()圖。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：



九、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於一種 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物、其鹽類以及含該化合物作為活性成分之蟲害防治劑，尤其是關於一種植物疾病防治劑、殺線蟲劑、及其使用方法。

【先前技術】

習知地，某些種類之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物係已知具有殺真菌活性(例如，請參見 JP-A-1-151546、WO 04/016088、WO 04/074280 或 WO 06/016708)。

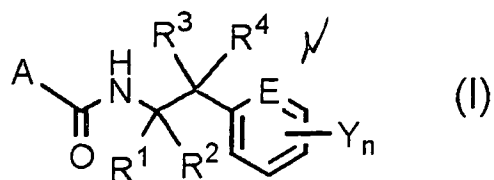
然而，於 JP-A-1-151546 中所描述之苯乙基甲醯胺衍生物在實用層面上很難顯出抗植物疾病之活性。雖然於 WO 04/016088、WO 04/074280 及 WO 06/016708 中所描述之甲醯胺衍生物有時可顯出高殺菌活性，但該等甲醯胺衍生物在不具有足以令人滿意的殺真菌範圍等方面仍存有問題。因此，於先前技術中，植物疾病防治劑的效果和防治範圍並非全然足夠。近年來，由於全球環境負荷已獲得重視，這將引起對於用作在低劑量下顯現寬廣防治範圍的植物疾病防治劑之化合物之需求。

本發明人從事深入研究欲解決上述之問題，並發現本發明之式(I)所示之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物及其鹽類作為植物疾病防治劑具有優異之防治效果和極寬廣的殺真菌範圍，且具殺線蟲活性，因而完成本發明。

【發明內容】

因此，本發明係關於：

[1] 一種式(I)所示之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽類：



其中， R^1 和 R^2 各自獨立為

氫原子；或

(C_1 - C_3)烷基，

或

R^1 和 R^2 視需要相互鍵結形成

(C_3 - C_6)環烷，

R^3 和 R^4 各自獨立為

氫原子；

鹵原子；或

(C_1 - C_6)烷基，或

R^3 和 R^4 視需要相互鍵結形成

(C_3 - C_6)環烷，

當 A 為以式(A3)所示之經取代的環狀基時，則 R^3 和 R^4 視需要組合形成氧原子，

每個 Y 各自獨立為

鹵原子；

氰基；

羥基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基；

視需要經鹵原子取代之 (C_2-C_6) 烯基；

視需要經鹵原子取代之 (C_2-C_6) 炔基；

視需要經選自由鹵原子和 (C_1-C_6) 烷氧基所組成之群組之取代基取代之 (C_1-C_6) 烷氧基；

視需要經鹵原子取代之 (C_2-C_6) 烯氧基；

視需要經鹵原子取代之 (C_2-C_6) 炔氧基；

視需要經鹵原子取代之 (C_1-C_6) 烷硫基；

視需要經鹵原子取代之 (C_1-C_6) 烷基亞砷基；

視需要經鹵原子取代之 (C_1-C_6) 烷基砷基；

(C_1-C_6) 烷氧基-羰基；

(C_1-C_6) 烷氧基亞胺 (C_1-C_3) 烷基；

(C_3-C_{30}) 三烷基矽烷基；

視需要經一個或多個取代基取代之苯基，該等取代基係選自取代基群組 Z；

視需要經一個或多個取代基取代之苯氧基，該等取代基係選自取代基群組 Z；或

視需要經一個或多個取代基取代之雜環基氧基，該等取代基係選自取代基群組 Z，

n 為 1 至 5 的整數，

當 n 為 2 至 5 的整數時，則相鄰的兩個 Y 視需要彼此鍵結以形成

(C_3-C_5) 伸烷基；

(C_3-C_5) 伸烯基；

(C_2-C_4) 伸烷基氧基；或

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)伸烷基二氧基，
取代基群組 Z 為

氫原子；

鹵原子；

氰基；

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷基；

視需要經鹵原子取代之(C_2-C_6)烯基；

視需要經鹵原子取代之(C_2-C_6)炔基；

● 視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷氧基；

視需要經鹵原子取代之(C_2-C_6)烯氧基；

視需要經鹵原子取代之(C_2-C_6)炔氧基；

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷硫基；

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷基亞碲基；

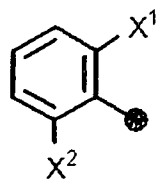
視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷基碲基；

(C_1-C_6)烷氧基-羰基；

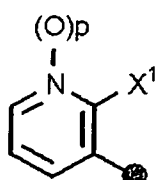
● (C_1-C_6)烷氧基亞胺(C_1-C_3)烷基；或

胺甲醯基，

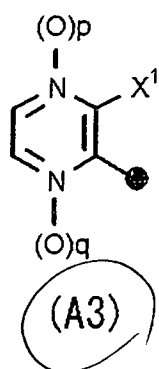
A 係選自由式(A1)至(A10)所組成之群組之經取代環狀基：



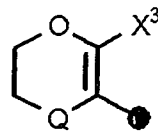
(A1)



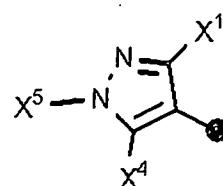
(A2)



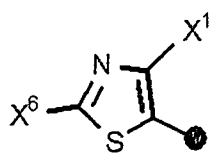
(A3)



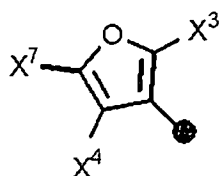
(A4)



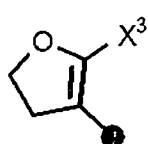
(A5)



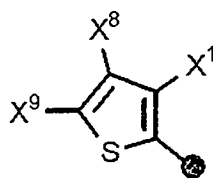
(A6)



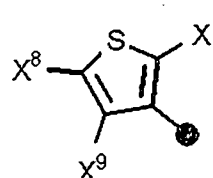
(A7)



(A8)



(A9)



(A10)

其中， X^1 為

鹵原子；

視需要經鹵原子取代之 (C_1-C_3) 烷基；

視需要經鹵原子取代之 (C_1-C_3) 烷氧基；

或

視需要經鹵原子取代之 (C_1-C_3) 烷硫基，

X^2 為

氫原子；或

鹵原子，

X^3 為視需要經鹵原子取代之 (C_1-C_3) 烷基，

X^4 、 X^7 、 X^8 和 X^9 各自獨立為

氫原子；

鹵原子；或

視需要經鹵原子取代之 (C_1-C_3) 烷基，

X^5 為

氫原子；或

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₃)烷基，

X⁶ 為

氫原子；

胺基；

單(C₁-C₃)烷胺基；

二(C₁-C₃)烷胺基；

鹵原子；或

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₃)烷基，

Q 為

氧原子；

硫原子；

-SO₂-或

-CH₂-，

p 和 q 各自獨立為 0 或 1，以及

E 為

C-H；

C-Y(Y 係如上所定義者)；或

氮原子，

惟：

(1)當 E 為氮原子時，則 A 為式(A3)所示之經取代之環狀基，以及

(2)不包括 2,6-二氯-N-[2-{3-(三氟甲基)苯基}乙基]苯甲醯胺；

[2]如上述[1]之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽

類，其中，E 為 C-H 或 C-Y(Y 係如上述[1]所定義者)；

[3]如上述[1]或[2]之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽類，其中，

A 為式(A1)所示之經取代之環狀基；

[4]如上述[1]至[3]中任一項之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽類，其中，

A 為式(A1)所示之經取代之環狀基，

E 為

C-H 或

C-Y(Y 係如下所定義者)，

R^1 和 R^2 各自獨立為

氫原子；或

(C_1 - C_3)烷基，或

R^1 和 R^2 視需要相互鍵結形成

(C_3 - C_6)環烷，

R^3 和 R^4 各自獨立為

氫原子；

鹵原子；或

(C_1 - C_6)烷基，或

R^3 和 R^4 視需要相互鍵結形成

(C_3 - C_6)環烷，

每個 Y 各自獨立為

鹵原子；

氰基；

羥基；

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷基；

視需要經選自由鹵原子和(C_1-C_6)烷氧基所組成之群組之
取代基取代之(C_1-C_6)烷氧基；

視需要經鹵原子取代之(C_2-C_6)烯氧基；

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷硫基；

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷基亞碲基；

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷基碲基；

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯基，該
等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷基以及

(iii) 視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷氧基；

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯氧基，
該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷基以及

(iii) 視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷氧基；或

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之雜環基氧
基，該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷基以及

(iii) 視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷氧基，

n 為 1 至 3 的整數，

當 n 為 2 或 3 的整數時，則相鄰的兩個 Y 視需要彼此鍵結以形成

(C_3-C_5)伸烷基；

(C_3-C_5)伸烯基；

(C_2-C_4)伸烷基氧基；或

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)伸烷基二氧基，

X^1 為

鹵原子；

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)烷基；

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)烷氧基；或

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)烷硫基，以及

X^2 為

氫原子；或

鹵原子；

[5]如上述[1]或[2]之 N -2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽類，其中，

A 為式(A2)所示之經取代之環狀基；

[6]如上述[1]、[2]和[5]中任一項之 N -2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽類，其中，

A 為式(A2)所示之經取代之環狀基，

E 為

$C-H$ 或

$C-Y$ (Y 係如下所定義者)，

R^1 和 R^2 各自獨立為

氫原子；或

(C₁-C₃)烷基，或

R¹ 和 R² 視需要相互鍵結形成

(C₃-C₆)環烷，

R³ 和 R⁴ 各自獨立為

氫原子；

鹵原子；或

(C₁-C₆)烷基，或

R³ 和 R⁴ 視需要相互鍵結形成

(C₃-C₆)環烷，

每個 Y 各自獨立為

鹵原子；

氰基；

羥基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基；

視需要經選自由鹵原子和(C₁-C₆)烷氧基所組成之群組之
取代基取代之(C₁-C₆)烷氧基；

視需要經鹵原子取代之(C₂-C₆)烯氧基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷硫基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基亞碲基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基碲基；

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯基，該
等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii)視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷基以及

(iii)視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷氧基；

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯氧基，

該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i)鹵原子，

(ii)視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷基以及

(iii)視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷氧基；或

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之雜環基氧

基，該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i)鹵原子，

(ii)視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷基以及

(iii)視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷氧基，

n 為 1 至 3 的整數，

當 n 為 2 或 3 的整數時，則相鄰的兩個 Y 視需要彼此鍵結以形成

(C_3-C_5)伸烷基；

(C_3-C_5)伸烯基；

(C_2-C_4)伸烷基氧基；或

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)伸烷基二氧基，

X^1 為

鹵原子；或

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)烷基，以及

p 為 0；

[7]如上述[1]或[2]之 N -2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其

鹽類，其中，

A 為式(A3)所示之經取代之環狀基；

[8] 如上述[1]或[7]之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其

鹽類，其中，

A 為式(A3)所示之經取代之環狀基，

E 為

C-H；

C-Y(Y 係如下所定義者)或

氮原子，

R^1 和 R^2 各自獨立為

氫原子；或

(C_1 - C_3)烷基，或

R^1 和 R^2 視需要相互鍵結形成

(C_3 - C_6)環烷，

R^3 和 R^4 各自獨立為

氫原子；

鹵原子；或

(C_1 - C_6)烷基，

R^3 和 R^4 視需要相互鍵結形成

(C_3 - C_6)環烷，或

R^3 和 R^4 視需要組合形成氧原子，

每個 Y 各自獨立為

鹵原子；

氰基；

羥基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷氧基；

視需要經鹵原子取代之(C₂-C₆)烯氧基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷硫基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基亞砷基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基砷基；

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯基，該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基以及

(iii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷氧基；

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯氧基，該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基以及

(iii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷氧基；或

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之雜環基氧基，該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基以及

(iii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷氧基，

n 為 1 至 3 的整數，

當 n 為 2 或 3 的整數時，則相鄰的兩個 Y 視需要彼此鍵結

以形成

(C₃-C₅)伸烷基；

(C₃-C₅)伸烯基；

(C₂-C₄)伸烷基氧基；或

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₃)伸烷基二氧基，

X¹ 為

鹵原子；或

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₃)烷基，以及

p 和 q 各為 0；

[9]如上述[8]之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽類，其中，E 為 C-H 或 C-Y(Y 係如上述[8]所定義者)；

[10]如上述[1]或[2]之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽類，其中，

A 為式(A4)所示之經取代之環狀基；

[11]如上述[1]、[2]和[10]中任一項之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽類，其中，

A 為式(A4)所示之經取代之環狀基，

E 為

C-H 或

C-Y(Y 係如下所定義者)，

R¹ 和 R² 各自獨立為

氫原子；或

(C₁-C₃)烷基，

R³ 和 R⁴ 各自獨立為

氫原子；

鹵原子；或

(C₁-C₆)烷基，或

R³ 和 R⁴ 視需要相互鍵結形成

(C₃-C₆)環烷，

每個 Y 各自獨立為

鹵原子；

氰基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷氧基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷硫基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基亞砷基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基砷基；

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯基，該

等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基以及

(iii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷氧基；或

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯氧基，

該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基以及

(iii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷氧基，

n 為 1 至 3 的整數，

當 n 為 2 或 3 的整數時，則相鄰的兩個 Y 視需要彼此鍵結以形成

(C₃-C₅)伸烷基；

(C₃-C₅)伸烯基；

(C₂-C₄)伸烷基氧基；或

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₃)伸烷基二氧基，

X³ 為視需要經鹵原子取代之(C₁-C₃)烷基，以及

Q 為硫原子；

[12]如上述[1]或[2]之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽類，其中，

A 為式(A5)所示之經取代之環狀基；

[13]如上述[1]、[2]和[12]中任一項之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽類，其中，

A 為式(A5)所示之經取代之環狀基，

E 為

C-H 或

C-Y(Y 係如下所定義者)，

R¹ 和 R² 各自獨立為

氫原子；或

(C₁-C₃)烷基，

R³ 和 R⁴ 各自獨立為

氫原子；

鹵原子；或

(C₁-C₆)烷基，或

R^3 和 R^4 視需要相互鍵結形成

(C_3 - C_6)環烷，

每個 Y 各自獨立為

鹵原子；

氰基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷氧基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷硫基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基亞碲基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基碲基；

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯基，該

等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基以及

(iii) 視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷氧基；或

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯氧基，

該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基以及

(iii) 視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷氧基，

n 為 1 至 3 的整數，

當 n 為 2 或 3 的整數時，則相鄰的兩個 Y 視需要彼此鍵結

以形成

(C_3 - C_5)伸烷基；

(C₃-C₅)伸烯基；

(C₂-C₄)伸烷基氧基；或

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₃)伸烷基二氧基，

X¹ 為

鹵原子；或

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₃)烷基，

X⁴ 為

氫原子；

鹵原子；或

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₃)烷基，以及

X⁵ 為

氫原子；或

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₃)烷基；

[14]如上述[1]或[2]之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽類，其中，

A 為式(A6)所示之經取代之環狀基；

[15]如上述[1]、[2]和[14]中任一項之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽類，其中，

A 為式(A6)所示之經取代之環狀基，

E 為

C-H 或

C-Y(Y 係如下所定義者)，

R¹ 和 R² 各自獨立為

氫原子；或

(C₁-C₃)烷基，

R³ 和 R⁴ 各自獨立為

氫原子；

鹵原子；或

(C₁-C₆)烷基，或

R³ 和 R⁴ 視需要相互鍵結形成

(C₃-C₆)環烷，

每個 Y 各自獨立為

鹵原子；

氰基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷氧基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷硫基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基亞砷基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基砷基；

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯基，該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基以及

(iii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷氧基；或

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯氧基，該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基以及

(iii)視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷氧基，

n 為 1 至 3 的整數，

當 n 為 2 或 3 的整數時，則相鄰的兩個 Y 視需要彼此鍵結以形成

(C_3-C_5)伸烷基；

(C_3-C_5)伸烯基；

(C_2-C_4)伸烷基氧基；或

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)伸烷基二氧基，

X^1 為

鹵原子；或

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)烷基，以及

X^6 為

氫原子；

胺基；

單(C_1-C_3)烷胺基；

二(C_1-C_3)烷胺基；

鹵原子；或

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)烷基；

[16]如上述[1]或[2]之 N -2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽類，其中，

A 為式(A7)所示之經取代之環狀基；

[17]如上述[1]、[2]和[16]中任一項之 N -2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽類，其中，

A 為式(A7)所示之經取代之環狀基，

E 為

C-H 或

C-Y(Y 係如下所定義者)，

R^1 和 R^2 各自獨立為

氫原子；或

(C_1 - C_3)烷基，

R^3 和 R^4 各自獨立為

氫原子；

鹵原子；或

(C_1 - C_6)烷基，或

R^3 和 R^4 視需要相互鍵結形成

(C_3 - C_6)環烷，

每個 Y 各自獨立為

鹵原子；

氰基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷氧基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷硫基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基亞碲基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基碲基；

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯基，該

等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基以及

(iii) 視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷氧基；或
 視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯氧基，
 該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷基以及

(iii) 視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷氧基，

n 為 1 至 3 的整數，

當 n 為 2 或 3 的整數時，則相鄰的兩個 Y 視需要彼此鍵結
 以形成

(C_3-C_5)伸烷基；

(C_3-C_5)伸烯基；

(C_2-C_4)伸烷基氧基；或

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)伸烷基二氧基，

X^3 為視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)烷基，以及

X^4 和 X^7 各自獨立為

氫原子；

鹵原子；或

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)烷基；

[18] 如上述 [1] 或 [2] 之 N -2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其
 鹽類，其中，

A 為式 (A8) 所示之經取代之環狀基；

[19] 如上述 [1]、[2] 和 [18] 中任一項之 N -2-(雜)芳基乙基甲
 醯胺衍生物或其鹽類，其中，

A 為式 (A8) 所示之經取代之環狀基，

E 為

C-H 或

C-Y(Y 係如下所定義者)，

R^1 和 R^2 各自獨立為

氫原子；或

(C_1 - C_3)烷基，

R^3 和 R^4 各自獨立為

氫原子；

鹵原子；或

(C_1 - C_6)烷基，或

R^3 和 R^4 視需要相互鍵結形成

(C_3 - C_6)環烷，

每個 Y 各自獨立為

鹵原子；

氰基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷氧基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷硫基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基亞碲基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基碲基；

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯基，該

等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基以及

(iii)視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷氧基；或
視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯氧基，
該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i)鹵原子，

(ii)視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷基以及

(iii)視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷氧基，

n 為 1 至 3 的整數，

當 n 為 2 或 3 的整數時，則相鄰的兩個 Y 視需要彼此鍵結
以形成

(C_3-C_5)伸烷基；

(C_3-C_5)伸烯基；

(C_2-C_4)伸烷基氧基；或

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)伸烷基二氧基，以及

X^3 為視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)烷基；

[20]如上述[1]或[2]之 N -2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其
鹽類，其中，

A 為式(A9)所示之經取代之環狀基；

[21]如上述[1]、[2]和[20]中任一項之 N -2-(雜)芳基乙基甲
醯胺衍生物或其鹽類，其中，

A 為式(A9)所示之經取代之環狀基，

E 為

$C-H$ 或

$C-Y$ (Y 係如下所定義者)，

R^1 和 R^2 各自獨立為

氫原子；或

(C₁-C₃)烷基，

R³和R⁴各自獨立為

氫原子；

鹵原子；或

(C₁-C₆)烷基，或

R³和R⁴視需要相互鍵結形成

(C₃-C₆)環烷，

每個Y各自獨立為

鹵原子；

氰基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷氧基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷硫基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基亞砷基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基砷基；

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯基，該

等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i)鹵原子，

(ii)視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基以及

(iii)視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷氧基；或

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯氧基，

該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i)鹵原子，

(ii)視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷基以及

(iii)視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷氧基，

n 為 1 至 3 的整數，

當 n 為 2 或 3 的整數時，則相鄰的兩個 Y 視需要彼此鍵結以形成

(C_3-C_5)伸烷基；

(C_3-C_5)伸烯基；

(C_2-C_4)伸烷基氧基；或

● 視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)伸烷基二氧基，

X^1 為

鹵原子；或

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)烷基，以及

X^8 和 X^9 各自獨立為

氫原子；

鹵原子；或

● 視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)烷基；

[22]如上述[1]或[2]之 N -2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽類，其中，

A 為式(A10)所示之經取代之環狀基；

[23]如上述[1]、[2]和[22]中任一項之 N -2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽類，其中，

A 為式(A10)所示之經取代之環狀基，

E 為

$C-H$ 或

C-Y(Y 係如下所定義者)，

R^1 和 R^2 各自獨立為

氫原子；或

(C_1 - C_3)烷基，或

R^3 和 R^4 各自獨立為

氫原子；

鹵原子；或

(C_1 - C_6)烷基，或

R^3 和 R^4 視需要相互鍵結形成

(C_3 - C_6)環烷，

每個 Y 各自獨立為

鹵原子；

氰基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷氧基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷硫基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基亞碲基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基碲基；

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯基，該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基以及

(iii) 視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷氧基；或

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯氧基，

該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷基以及

(iii) 視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷氧基，

n 為 1 至 3 的整數，

當 n 為 2 或 3 的整數時，則相鄰的兩個 Y 視需要彼此鍵結以形成

(C_3-C_5)伸烷基；

(C_3-C_5)伸烯基；

(C_2-C_4)伸烷基氧基；或

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)伸烷基二氧基，

X^1 為視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)烷基，以及

X^8 和 X^9 各自獨立為

氫原子；

鹵原子；或

視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)烷基；

[24] 一種蟲害防治劑，含有如上述 [1] 至 [23] 中任一項之 N -2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽類作為活性成分；

[25] 如上述 [24] 之蟲害防治劑，該蟲害防治劑為植物疾病防治劑；

[26] 如上述 [24] 之蟲害防治劑，該蟲害防治劑為殺線蟲劑；以及

[27] 一種蟲害防治方法，包括以有效量之如上述 [24] 至 [26] 中任一項之蟲害防治劑處理目標作物植物或用於栽培該植

物之土壤。

本發明提供一種能展現出比先前技術更優異特性之適用作蟲害防治劑之化合物，尤其，本發明係提供一種於低劑量下具寬廣防治範圍之植物疾病防治劑或殺線蟲劑。

【實施方式】

以下將說明本發明 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物式 (I) 之定義。

“鹵原子”意指氯原子、溴原子、碘原子或氟原子。

“(C₁-C₆)烷基”為具有 1 至 6 個碳原子之直鏈或分支鏈烷基，例如甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、第二丁基、第三丁基、正戊基、新戊基、正己基等。

“(C₁-C₃)烷基”為具有 1 至 3 個碳原子之直鏈或分支鏈烷基，例如甲基、乙基、正丙基、異丙基等。

“視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基”為具有 1 至 6 個碳原子之直鏈或分支鏈烷基，例如甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、第二丁基、第三丁基、正戊基、新戊基、正己基等；而該具有 1 至 6 個碳原子之直鏈或分支鏈烷基係經一個或多個相同或不同鹵原子取代，例如，三氟甲基、二氟甲基、全氟乙基、全氟異丙基、氯甲基、溴甲基、1-溴乙基、2,3-二溴丙基等。

“視需要經鹵原子取代之(C₁-C₃)烷基”為具有 1 至 3 個碳原子之直鏈或分支鏈烷基，例如甲基、乙基、正丙基、異丙基等；該具有 1 至 3 個碳原子之直鏈或分支鏈烷基係經一個或多個相同或不同鹵原子取代，例如，三氟甲基、

二氟甲基、全氟乙基、全氟異丙基、氟甲基、溴甲基、1-溴乙基、2,3-二溴丙基等。

“視需要經鹵原子取代之(C_2-C_6)烯基”為具有 2 至 6 個碳原子之直鏈或分支鏈烯基，例如乙烯基、丙烯基、丁烯基等；而該具有 2 至 6 個碳原子之直鏈或分支鏈烯基係經一個或多個相同或不同鹵原子取代，例如，氟乙烯基、二氟乙烯基、全氟乙烯基、3,3-二氟-2-丙烯基、4,4-二氟-3-丁烯基等。

“視需要經鹵原子取代之(C_2-C_6)炔基”為具有 2 至 6 個碳原子之直鏈或分支鏈炔基，例如乙炔基、丙炔基、丁炔基等；而該具有 2 至 6 個碳原子之直鏈或分支鏈炔基係經一個或多個相同或不同鹵原子取代，例如，氟乙炔基、全氟丙炔基、4,4,4-三氟-2-丁炔基等。

“視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷氧基”為具有 1 至 6 個碳原子之直鏈或分支鏈烷氧基，例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、第二丁氧基、第三丁氧基、正戊氧基、異戊氧基、新戊氧基、正己氧基等；而該具有 1 至 6 個碳原子之直鏈或分支鏈烷氧基係經一個或多個相同或不同鹵原子取代，例如，三氟甲氧基、二氟甲氧基、全氟乙氧基、全氟異丙氧基、氟甲氧基、溴甲氧基、1-溴乙氧基、2,3-二溴丙氧基等。

“視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)烷氧基”為具有 1 至 3 個碳原子之直鏈或分支鏈烷氧基，例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基等；而該具有 1 至 3 個碳原子之直鏈

或分支鏈烷氧基係經一個或多個相同或不同鹵原子取代，例如，三氟甲氧基、二氟甲氧基、全氟乙氧基、全氟異丙氧基、氯甲氧基、溴甲氧基、1-溴乙氧基、2,3-二溴丙氧基等。

“視需要經選自由鹵原子和(C₁-C₆)烷氧基所組成之群組之取代基取代之(C₁-C₆)烷氧基”為具有1至6個碳原子之直鏈或分支鏈烷氧基，例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、第二丁氧基、第三丁氧基、正戊氧基、異戊氧基、新戊氧基、正己氧基等；而該具有1至6個碳原子之直鏈或分支鏈烷氧基係經一個或多個相同或不同鹵原子和/或一個或多個相同或不同(C₁-C₆)烷氧基取代，例如，三氟甲氧基、二氟甲氧基、全氟乙氧基、全氟異丙氧基、氯甲氧基、溴甲氧基、1-溴乙氧基、2,3-二溴丙氧基、甲氧基甲氧基、乙氧基甲氧基、丙氧基甲氧基、甲氧基乙氧基、乙氧基乙氧基等。

“視需要經鹵原子取代之(C₂-C₆)烯氧基”為具有2至6個碳原子之直鏈或分支鏈烯氧基，例如丙烯氧基、丁烯氧基、戊烯氧基等；而該具有2至6個碳原子之直鏈或分支鏈烯氧基係經一個或多個相同或不同鹵原子取代，例如，氟乙烯氧基、二氟乙烯氧基、全氟乙烯氧基、3,3-二氯-2-丙烯氧基、4,4-二氯-3-丁烯氧基等。

“視需要經鹵原子取代之(C₂-C₆)炔氧基”為具有2至6個碳原子之直鏈或分支鏈炔氧基，例如丙炔氧基、丁炔氧基、戊炔氧基等；而該具有2至6個碳原子之直鏈或分

支鏈炔氧基係經一個或多個相同或不同鹵原子取代，例如，氟乙炔氧基、全氟丙炔氧基、4,4,4-三氟-2-丁炔氧基等。

“視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷硫基”為具有1至6個碳原子之直鏈或分支鏈烷硫基，例如甲硫基、乙硫基、正丙硫基、異丙硫基、正丁硫基、第二丁硫基、第三丁硫基、正戊硫基、異戊硫基、正己硫基等；而該具有1至6個碳原子之直鏈或分支鏈烷硫基係經一個或多個相同或不同鹵原子取代，例如，三氟甲硫基、二氟甲硫基、全氟乙硫基、全氟異丙硫基、氟甲硫基、溴甲硫基、1-溴乙硫基、2,3-二溴丙硫基等。

“視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)烷硫基”為具有1至3個碳原子之直鏈或分支鏈烷硫基，例如甲硫基、乙硫基、正丙硫基、異丙硫基等；而該具有1至3個碳原子之直鏈或分支鏈烷硫基係經一個或多個相同或不同鹵原子取代，例如，三氟甲硫基、二氟甲硫基、全氟乙硫基、全氟異丙硫基、氟甲硫基、溴甲硫基、1-溴乙硫基、2,3-二溴丙硫基等。

“視需要經鹵原子取代之(C_1-C_6)烷基亞砷基”為具有1至6個碳原子之直鏈或分支鏈烷基亞砷基，例如甲基亞砷基、乙基亞砷基、正丙基亞砷基、異丙基亞砷基、正丁基亞砷基、第二丁基亞砷基、第三丁基亞砷基、正戊基亞砷基、異戊基亞砷基、正己基亞砷基等；而該具有1至6個碳原子之直鏈或分支鏈烷基亞砷基係經一個或多個相同

或不同鹵原子取代，例如，三氟甲基亞碲基、二氟甲基亞碲基、全氟乙基亞碲基、全氟異丙基亞碲基、氟甲基亞碲基、溴甲基亞碲基、1-溴乙基亞碲基、2,3-二溴丙基亞碲基等。

“視需要經鹵原子取代之 (C_1-C_6) 烷基碲基”為具有1至6個碳原子之直鏈或分支鏈烷基碲基，例如甲基碲基、乙基碲基、正丙基碲基、異丙基碲基、正丁基碲基、第二丁基碲基、第三丁基碲基、正戊基碲基、異戊基碲基、正己基碲基等；而該具有1至6個碳原子之直鏈或分支鏈烷基碲基係經一個或多個相同或不同鹵原子取代，例如，三氟甲基碲基、二氟甲基碲基、全氟乙基碲基、全氟異丙基碲基、氟甲基碲基、溴甲基碲基、1-溴乙基碲基、2,3-二溴丙基碲基等。

“ (C_1-C_6) 烷氧基-羰基”為烷氧基-羰基中之烷氧基係直鏈或分支鏈且具有1至6個碳原子，例如甲氧羰基、乙氧羰基、正丙氧羰基、異丙氧羰基、正丁氧羰基、第三丁氧羰基等。

“ (C_1-C_6) 烷氧基亞胺 (C_1-C_3) 烷基”為烷氧基亞胺 (C_1-C_3) 烷基中之烷氧基係直鏈或分支鏈且具有1至6個碳原子，例如甲氧基亞胺甲基、乙氧基亞胺甲基、正丙氧基亞胺甲基、異丙氧基亞胺乙基等。

“ (C_3-C_{30}) 三烷基矽烷基”為總共具有3至30個碳原子之直鏈或分支鏈烷基矽烷基，例如三甲基矽烷基、三乙基矽烷基等。

至於由 R^1 和 R^2 或 R^3 和 R^4 相互鍵結形成三“(C₃-C₆)環烷”，其可為環丙烷、環丁烷、環戊烷、環己烷等。

至於“(C₃-C₅)伸烷基”，其可為三亞甲基、四亞甲基、五亞甲基等。

至於“(C₃-C₅)伸烯基”，其可為 -CH₂-CH=CH-、
-CH₂-CH₂-CH=CH-、-CH=CH-CH=CH-、
-CH₂-CH₂-CH₂-CH=CH-、-CH₂-CH₂-CH=CH-CH₂-、
-CH=CH-CH=CH-CH₂-等。

至於“(C₂-C₄)伸烷基氧基”，其可為 -CH₂-CH₂-O-、
-CH₂-CH₂-CH₂-O-、-CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-O-等。

至於“視需要經鹵原子取代之(C₁-C₃)伸烷基二氧基”，其為具有 1 至 3 個碳原子之伸烷基二氧基，例如 -O-CH₂-O-、-O-CH₂-CH₂-O-、-O-CH₂-CH₂-CH₂-O-等；而該伸烷基二氧基係經一個或多個相同或不同鹵原子取代，例如，-O-CF₂-O-、-O-CF₂-CF₂-O-、-O-CCl₂-O-等。

“單(C₁-C₃)烷胺基”為烷胺基中之烷基係直鏈或分支鏈且具有 1 至 3 個碳原子，例如甲胺基、乙胺基、正丙胺基、異丙胺基等。

“二(C₁-C₃)烷胺基”為胺基中具有兩個相同或不同之具 1 至 3 個碳原子之直鏈或分支鏈烷基，例如二甲胺基、二乙胺基、二-正丙胺基、二-異丙胺基、N-甲基-N-乙基胺基、N-甲基-N-異丙胺基等。

“雜環基氧基”為具有 1 至 3 個相同或不同選自氧原子、硫原子和氮原子之雜原子之 5 員或 6 員雜環基氧基，

或其稠合之雜環基氧基，例如呋喃基氧基、噻吩基氧基、吡唑基氧基、咪唑基氧基、三唑基氧基、噻唑基氧基、吡啶基氧基、嘧啶基氧基、吡嗪基氧基、三嗪基氧基、吡咯基氧基、苯并噻唑基氧基、喹啉基氧基、喹唑啉基氧基、喹啶基氧基等。

為了避免偶然符合於習知化合物，本發明式(I)所示之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物係符合下列條件(1)與(2)：

- (1)當 E 為氮原子時，則 A 為式(A3)所示之經取代之環狀基。
- (2)不包括 2,6-二氯-N-[2-{3-(三氯甲基)苯基}乙基]苯甲醯胺。

至於本發明式(I)所示之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物之鹽類，可列舉下列各者作為實例：例如，無機酸鹽類如：鹽酸鹽、硫酸鹽、硝酸鹽、磷酸鹽等；有機酸鹽類如：醋酸鹽、反丁烯二酸鹽、順丁烯二酸鹽、草酸鹽、甲烷磺酸鹽、苯磺酸鹽、對甲苯磺酸鹽等；以及具有有機或無機鹼如：鈉離子鉀離子、鈣離子、三甲銨等之鹽類。

在本發明式(I)所示之化合物中， R^1 和 R^2 較佳各為氫原子、甲基或乙基。而更佳者為 R^1 和 R^2 之至少一者為氫原子，且由此形成之光學活性鏡像異構物之一者係為更佳者。

R^3 和 R^4 各自獨立為氫原子、氟原子，或 R^3 和 R^4 較佳相互鍵結形成環丙烷。

Y 較佳為鹵原子(例如氟原子、氯原子、溴原子、碘原

子等)、羥基、視需要經鹵原子取代之(C_1-C_4)烷基、視需要經鹵原子取代之(C_2-C_4)烯基、視需要經鹵原子取代之(C_1-C_4)烷氧基、視需要經鹵原子取代之(C_2-C_4)烯氧基、視需要經鹵原子取代之(C_1-C_4)烷硫基、視需要經該等選自取代基群組 Z 之取代基取代之苯基、或視需要經該等選自取代基群組 Z 之取代基取代之苯氧基，或較佳者為相鄰的兩個 Y 彼此鍵結形成視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)伸烷基二氧基。

Z 較佳為鹵原子、鹵(C_1-C_4)烷基或鹵(C_1-C_4)烷氧基。

n 較佳為 2 或 3。

A 較佳係選自由式(A1)、(A2)、(A3)、(A4)、(A5)、(A6)、(A7)、(A9)所組成之群組之經取代環狀基，而較佳者為式(A3)所示之經取代環狀基。

X^1 較佳為鹵原子、視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)烷基(例如三氟甲基、二氟甲基等)、視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)烷氧基(例如三氟甲氧基、二氟甲氧基等)、或視需要經鹵原子取代之(C_1-C_3)烷硫基(例如三氟甲硫基、二氟甲硫基等)，而更佳者為三氟甲基。

X^2 較佳為氫原子、氟原子或氯原子，而更佳者為氫原子。

X^3 較佳為甲基、三氟甲基或二氟甲基等。

X^4 、 X^7 、 X^8 和 X^9 較佳為氫原子。

X^5 較佳為甲基。

X^6 較佳為氫原子、胺基、氯原子或甲基。

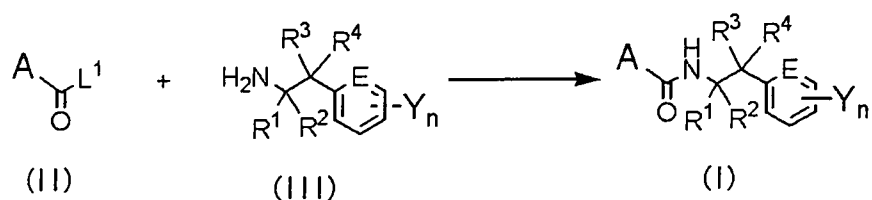
Q 較佳為硫原子。

p 和 q 較佳各為 0。

E 較佳為 C-H 或 C-Y (Y 為上述定義者)。

雖然本發明之化合物可例如，依照下列諸製造方法產生，但該等製造方法並不能用來限制本發明。

[製造方法 1]



其中 A、R¹、R²、R³、R⁴、E、Y 以及 n 係如上所定義者，而 L¹ 為脫離基，例如氯原子、溴原子、烷氧基等。

本發明式 (I) 所示之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物可在含有鹼的惰性溶劑存在下由式 (II) 所示之(雜)環羧酸衍生物與式 (III) 所示之 2-(雜)芳基乙基胺衍生物反應而生成者。

本反應之反應溫度一般係在 -20°C 至 120°C 的範圍內，且反應時間一般係在 0.2 小時至 24 小時範圍內。一般所使用之式 (III) 所示之 N-2-(雜)芳基乙基胺衍生物係在 0.2 倍至 5 倍莫耳的式 (II) 所示之(雜)環羧酸衍生物的範圍內。

至於鹼，可列舉例如無機鹼：如氫氧化鈉、氫氧化鉀、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鈉、碳酸氫鉀等；醋酸鹽類：如醋酸鈉、醋酸鉀等；鹼金屬烷氧化物：如第三丁氧鉀 (potassium t-butoxide)、甲氧鈉 (sodium methoxide)、乙氧鈉 (sodium ethoxide) 等；三級胺：如三乙胺、二異丙基乙

基胺、1,8-二氮雜雙環[5.4.0]十一碳-7-烯(1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene)等；含氮之芳香族化合物：如吡啶、二甲基胺基吡啶等，等。所使用之鹼的用量一般在 0.5 倍至 10 倍莫耳的式(II)所示之(雜)環羧酸衍生物的範圍內。

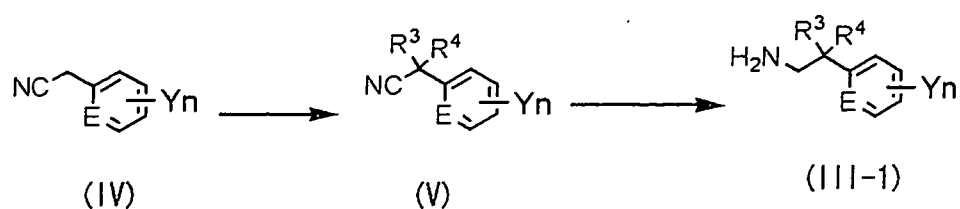
在本反應中，得使用溶劑或不使用溶劑。只要此溶劑不明顯抑制該反應，則任何溶劑皆可使用，例如，可使用醇類：如甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、2-丙醇等；直鏈狀或環狀醚類：如乙醚、四氫呋喃、二噁烷等；芳香族烴：如苯、甲苯、二甲苯等；經鹵化之烴：如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等；經鹵化之芳香族烴：如氯苯、二氯苯等；腈類：如乙腈等；酯類：如醋酸乙酯、醋酸丁酯等；極性溶劑：如 N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、二甲亞砜、1,3-二甲基-2-咪唑啉酮、水、醋酸等。此等惰性溶劑可單獨使用或以兩種或更多種該等溶劑的混合物使用。

反應完成之後，所欲之化合物可藉由習知方法從含有所欲化合物之反應混合物中單離出來，而且若有必要的话，則以再結晶法、管柱層析法等純化該化合物。

用於本反應中之式(II)所示之(雜)環羧酸衍生物可由已知刊物(例如，WO05/115994、WO01/42223、WO03/066609、WO03/066610、WO03/099803、WO03/099804、WO03/080628 等)所描述之方法，或其類似之方法，予以製造。

式(III)所示之 2-(雜)芳基乙基胺衍生物可依照，例如，下列之中間產物之製造方法 1 至 4 而產生。

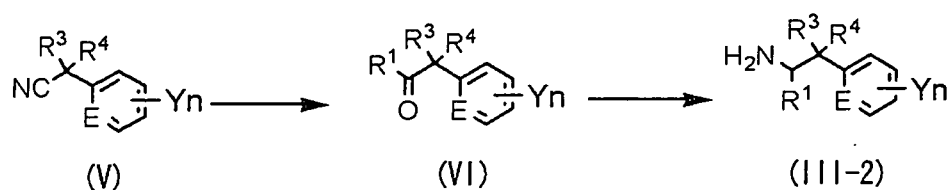
[中間產物之製造方法 1](當 R^1 和 R^2 為氫原子時)



其中 R^3 、 R^4 、E、Y 以及 n 係如上所定義者。

上述之反應可依照已知刊物(例如 Tetrahedron, 2002, 58(11), p.2211 等)所描述之方法, 或其類似之方法, 予以進行。也就是說, 式(III-1)所示之 2-(雜)芳基乙基胺衍生物可製造如下: 在含有鹼的惰性溶劑存在下由式(IV)所示之乙腈衍生物與對應之烷化劑反應以獲得式(V)所示之(雜)芳基乙腈衍生物, 之後在單離或未單離該(雜)芳基乙腈衍生物(V)的情況下, 於催化劑(例如, 雷氏鎳(Raney-nickel)等)存在下在惰性溶劑中進行氫化反應, 或使用還原劑(例如, 氫化鋁鋰等)進行還原反應。

[中間產物之製造方法 2](當 R^2 為氫原子時)

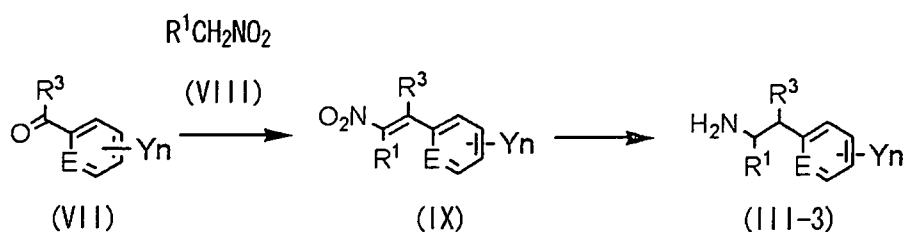


其中 R^1 、 R^3 、 R^4 、E、Y 以及 n 係如上所定義者。

上述之反應可依照已知刊物(例如 J. Med. Chem., 1986, 29, p.302; Angew. Chem., 1989, 28(2), p.218 等)所描述之方法, 或其類似之方法, 予以進行。也就是說, 式(III-2)所示之 2-(雜)芳基乙基胺衍生物可製如下: 將式(V)所示之(雜)芳基乙腈衍生物進行格林納反應(Grignard reaction)

以獲得式(VI)所示之酮類衍生物，之後在單離或未單離之該酮類衍生物的情況下進行洛伊卡特-華力克反應(Leuckart-Wallach reaction)或類似之還原胺化反應(reductive amination reaction)、或以該酮類衍生物與羥胺反應以獲得肟(hydroxime)衍生物，之後其在催化劑(例如，雷氏鎳等)存在下進行氫化反應。

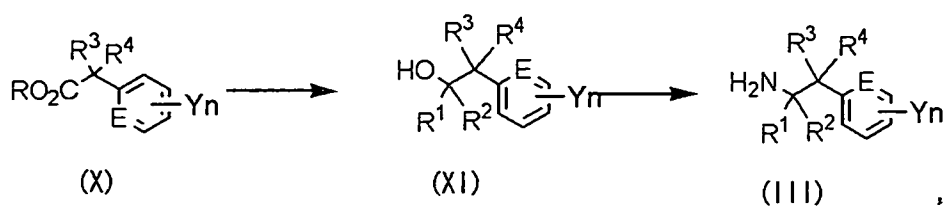
[中間產物之製造方法 3] (當 R^2 和 R^4 為氫原子時)



其中 R^1 、 R^3 、E、Y 以及 n 係如上所定義者。

上述之反應可依照已知刊物(例如 Tetrahedron, 1995, 51(18), p.5361 等)所描述之方法，或其類似之方法，予以進行。也就是說，式(III-3)所示之 2-(雜)芳基乙基胺衍生物可製造如下：將式(VII)所示之酮類衍生物與式(VIII)所示之硝基烷反應以獲得式(IX)所示之硝基烯衍生物，之後在單離或未單離該硝基烯衍生物(IX)的情況下，用鋅粉末等進行金屬還原反應、使用催化劑(例如，雷氏鎳等)進行催化性氫化反應、或使用還原劑(例如，氫化鋁鋰等)進行還原反應。

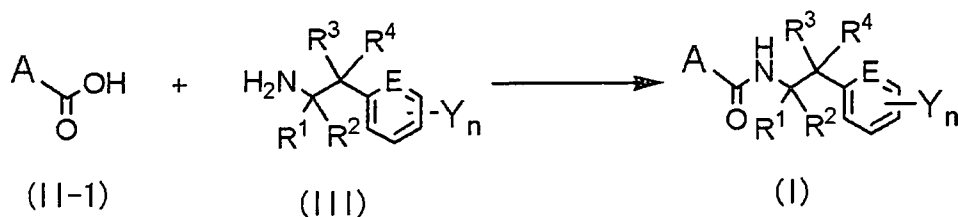
[中間產物之製造方法 4]



其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 E 、 Y 以及 n 係如上所定義者。

上述之反應可依照已知刊物(例如 J. Am. Chem. Soc., 1950, 72, p.2786 等)所描述之方法，或其類似之方法，予以進行。也就是說，式(III)所示之 2-(雜)芳基乙基胺衍生物可製造如下：將式(X)所示之(雜)芳基醋酸酯衍生物進行格林納反應(Grignard reaction)或類似之反應以獲得式(XI)所示之(雜)芳基乙基醇衍生物，之後使由該(雜)芳基乙基醇衍生物(XI)所得之(雜)芳基乙基鹵化物衍生物進行加佈雷爾反應(Gabriel reaction)，或使由該醇類衍生物所得之(雜)芳基乙基疊氮化物衍生物進行還原反應。

[製造方法 2]



其中 A 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 E 、 Y 以及 n 係如上所定義者。

本發明式(I)所示之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物可在縮合劑及鹼的存在下，於惰性溶劑中由式(II-1)所示之(雜)環羧酸與式(III)所示之 2-(雜)芳基乙基胺衍生物反應而生成者。

本反應之反應溫度一般係在 -20°C 至 120°C 的範圍內，且反應時間一般係在 0.2 小時至 24 小時範圍內。一般所使用之式(III)所示之 N-2-(雜)芳基乙基胺衍生物係在 0.2 倍至 5 倍莫耳的式(II-1)所示之(雜)環羧酸衍生物的範圍內。

至於本反應所使用之縮合劑，可列舉例如氰代磷酸二

乙酯(diethylphosphorylcyanoide: 簡稱作 DEPC)、羰基二咪唑(carbonyldiimidazole: 簡稱作 CDI)、1,3-二環己基碳二亞胺(DCC)、1-乙基-3-(3-二甲基胺基丙基)碳二亞胺鹽酸鹽、氯碳酸酯、碘化 2-氯-1-甲基吡啶等，而縮合劑之用量一般係在 0.5 倍至 3 倍莫耳的式(II-1)所示之(雜)環羧酸衍生物的範圍內。

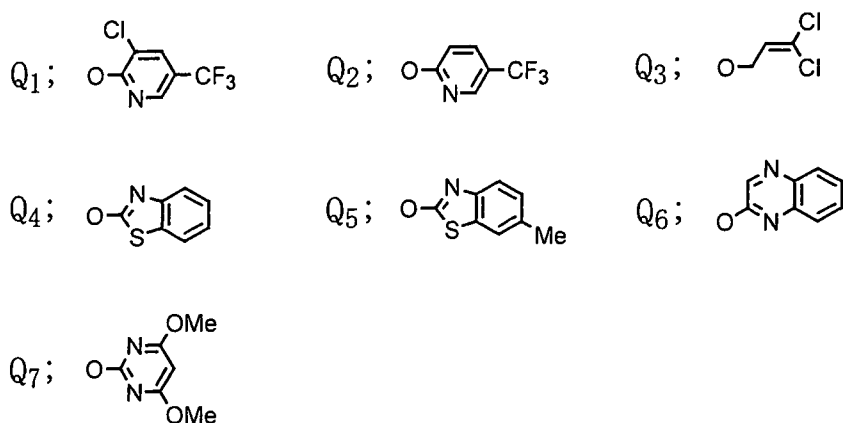
至於所使用之鹼，可列舉例如無機鹼：如氫氧化鈉、氫氧化鉀、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鈉、碳酸氫鉀等；醋酸鹽類：如醋酸鈉、醋酸鉀等；鹼金屬烷氧化物：如第三丁氧鉀(potassium t-butoxide)、甲氧鈉(sodium methoxide)、乙氧鈉(sodium ethoxide)等；三級胺：如三乙胺、二異丙基乙基胺、1,8-二氮雜雙環[5.4.0]十一碳-7-烯(1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene)等；含氮之芳香族化合物：如吡啶、二甲基胺基吡啶等，等。所使用之鹼的用量一般在 0.5 倍至 10 倍莫耳的式(II-1)所示之(雜)環羧酸衍生物的範圍內。

只要此溶劑不明顯抑制該反應，則任何溶劑皆可用於本反應中，例如，可使用直鏈狀或環狀醚類：如乙醚、四氫呋喃、二噁烷等；芳香族烴：如苯、甲苯、二甲苯等；經鹵化之烴：如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等；經鹵化之芳香族烴：如氯苯、二氯苯等；腈類：如乙腈等；酯類：如醋酸乙酯、醋酸丁酯等；極性溶劑：如 N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、二甲亞砜、1,3-二甲基-2-咪唑啶酮等。該等溶劑可單獨使用或以兩種或更多種該等溶劑之

混合物使用。

反應完成之後，所欲之化合物可藉由習知方法從含有所欲化合物之反應混合物中單離出來，而且若有必要的話，則以再結晶法、管柱層析法等純化該化合物。

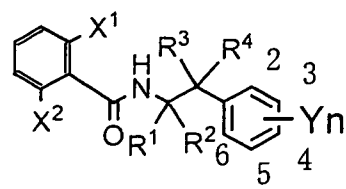
由此獲得之本發明式(I)所示之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物的代表性實例係列於表 1 至表 11 中。然而，本發明之衍生物並不只限於此表 1 至表 11 中。在表 1 至表 11 中，“Me”表示甲基，“Et”表示乙基，“Pr”表示丙基，“Bu”表示丁基，“Ph”表示苯基，“i-”表示異位，而“Q1-Q7”表示下列結構：



於性質欄中顯示熔點(°C)或折射率 n_D (量測溫度(°C))。

表 3 中，化合物第 3-43-R 和 3-43-S 號為化合物第 3-43 號的光學活性形式，而 3-43-R 的旋光度 $[\alpha]_D^{25.0} = -48.18$ (C=1.00, CHCl₃) 且 3-43-S 的旋光度 $[\alpha]_D^{25.0} = +48.10$ (C=1.00, CHCl₃)。此外，對於在表 1 至表 11 中的性質欄裡顯示“Paste”之化合物，該等化合物的 ¹H NMR 光譜數據係顯示於表 12 中。

表 1



化合物 編號	X ¹	X ²	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
1-1	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl	104.9-105.7
1-2	CF ₃	H	H	H	H	H	3-CF ₃	63-65
1-3	CF ₃	H	H	H	H	H	4-Cl	116.6-117.6
1-4	CF ₃	H	H	H	Me	H	4-Cl	89
1-5	CF ₃	H	H	H	Me	Me	4-Cl	91-92
1-6	CF ₃	H	H	H	Et	H	4-Cl	Paste
1-7	CF ₃	H	H	H	Me	Et	4-Cl	Paste
1-8	CF ₃	H	H	H	Et	Et	4-Cl	Paste
1-9	CF ₃	H	H	H	i-Bu	H	4-Cl	Paste
1-10	I	H	H	H	Me	H	4-Cl	119
1-11	I	H	H	H	Me	Me	4-Cl	121-122
1-12	I	H	H	H	Et	H	4-Cl	103
1-13	I	H	H	H	Me	Et	4-Cl	Paste
1-14	I	H	H	H	Et	Et	4-Cl	Paste
1-15	I	H	H	H	i-Bu	H	4-Cl	86-91
1-16	CF ₃	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	104.2-105.2
1-17	CF ₃	H	H	H	H	H	2,3-Cl ₂	135-136
1-18	I	H	H	H	H	H	2,3-Cl ₂	145-146
1-19	CF ₃	H	H	H	H	H	2,6-Cl ₂	148.4-149.4
1-20	CF ₃	H	H	H	H	H	3,4-Cl ₂	95-96.8
1-21	I	H	H	H	H	H	3,4-Cl ₂	107.2-109.2
1-22	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl-4-F	81.5-82.8
1-23	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Me-4-Cl	97-98
1-24	I	H	H	H	H	H	2-Me-4-Cl	121-122.7
1-25	CF ₃	H	H	H	H	H	2,5-Cl ₂	89.8-90.9
1-26	CF ₃	H	H	H	H	H	2,4-(CF ₃) ₂	112.9-113.7
1-27	CF ₃	H	H	H	H	H	2,4-Me ₂	75.1-77.2
1-28	CF ₃	H	H	H	H	H	2,5-Me ₂	94-95
1-29	I	H	H	H	H	H	2,5-Me ₂	115-116
1-30	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl-5-CF ₃	95.7-96.9
1-31	I	H	H	H	H	H	2-Cl-5-CF ₃	122-123

表 1(接續)

化合物 編號	X ¹	X ²	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
1-32	CF ₃	H	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	142
1-33	I	H	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	161-162
1-34	CF ₃	H	H	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	108-112
1-35	I	H	H	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	101-103
1-36	F	F	H	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	99-101
1-37	CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	107-110
1-38	I	H	Me	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	50-51
1-39	CF ₃	H	H	H	H	H	2-F-4-CF ₃	94-97
1-40	I	H	H	H	H	H	2-F-4-CF ₃	118
1-41	SCHF ₂	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	103
1-42	I	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	125-126
1-43	Br	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	127-128
1-44	Cl	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	124-126
1-45	Me	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	136-138
1-46	F	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	78
1-47	F	F	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	75-76
1-48	OCF ₃	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	88-90
1-49	CF ₃	H	H	H	H	H	4-Ph(4'-OCF ₃)	64-65
1-50	CF ₃	H	H	H	H	H	2-F-4-Ph(4'-OCF ₃)	146-148
1-51	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	102-103
1-52	CF ₃	H	H	H	H	H	2-F-4-Cl	101-102
1-53	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	Paste
1-54	I	H	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	98-100
1-55	CF ₃	H	H	H	H	H	2,4-F ₂	94.4-95.8
1-56	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	Paste
1-57	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl-4-Q1	135.7-137.2
1-58	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl-4-Q2	137.8-138.8
1-59	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh	Paste
1-60	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	109.6-111.5
1-61	CF ₃	H	H	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	130-131.6
1-62	CF ₃	H	H	H	H	H	2,4,5-F ₃	
1-63	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	144.5-145.5
1-64	CF ₃	H	Me	H	H	H	2,4-F ₂	121.5-124.5
1-65	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-F-4-Cl	140.7-142.3
1-66	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-OH	169.2-171.6
1-67	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	

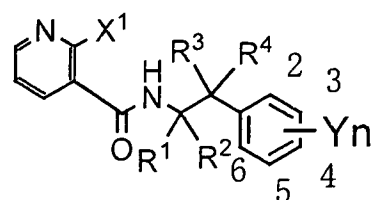
表 1(接續)

化合物 編號	X ¹	X ²	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
1-68	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCH ₂ OCH ₃	109.2-112.9
1-69	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q1	159.5-160.8
1-70	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
1-71	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q3	123.9-125.4
1-72	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q4	
1-73	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q5	
1-74	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q6	
1-75	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q7	
1-76	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh	118.3-119.8
1-77	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	
1-78	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-Cl)	
1-79	CF ₃	H	Me	H	H	H	2,4,5-F ₃	146.9-148.7
1-80	CF ₃	H	Me	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	169.1-169.8
1-81	CF ₃	H	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	133
1-82	I	H	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	143
1-83	CF ₃	H	Me	H	H	H	3-OCF ₂ O-4	
1-84	CF ₃	H	Me	H	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
1-85	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCF ₂ O-5	
1-86	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-F-4-OCF ₂ O-5	
1-87	CF ₃	H	Me	Me	H	H	2,4-Cl ₂	121
1-88	CF ₃	H	Me	Me	H	H	3,4-Cl ₂	
1-89	CF ₃	H	Me	Me	H	H	2,4-F ₂	
1-90	CF ₃	H	Me	Me	H	H	3,4-F ₂	
1-91	CF ₃	H	CH ₂ CH ₂	H	H	H	2,4-Cl ₂	
1-92	CF ₃	H	CH ₂ CH ₂	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
1-93	CF ₃	H	CH ₂ CH ₂	H	H	H	2-F-4-CF ₃	
1-94	CF ₃	H	H	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	95.4-96.2
1-95	CF ₃	H	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	160.2-161.1
1-96	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	103.6-104.7
1-97	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	
1-98	CF ₃	H	H	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	
1-99	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	
1-100	CF ₃	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	98.7-99
1-101	CF ₃	H	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	
1-102	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl-4-SMe	74.1-76.3

表 1(接續)

化合物 編號	X ¹	X ²	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
1-103	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-SMe	125.4-128.4
1-104	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl-4-SOMe	128.9-129.6
1-105	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me	135.4-137.1
1-106	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Br-4-Cl	143.0
1-107	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Br-4-F	106.4
1-108	CF ₃	H	H	H	H	H	3-OCF ₂ O-4	126.0
1-109	F	F	H	H	H	H	2-Cl-4-Q1	134.6-136.7

表 2



(I-2)

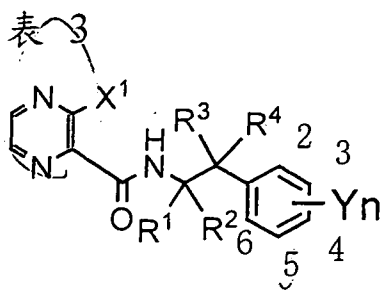
化合物 編號	X ¹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
2-1	CF ₃	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	104.2-105.2
2-2	Cl	H	H	H	H	2-Cl	92.4-93.3
2-3	Cl	H	H	H	H	3-CF ₃	82-87
2-4	Cl	H	H	H	H	4-Cl	112.5-113.2
2-5	Cl	H	H	Me	H	4-Cl	Paste
2-6	Cl	H	H	Me	Me	4-Cl	Paste
2-7	Cl	H	H	Et	H	4-Cl	Paste
2-8	Cl	H	H	Me	Et	4-Cl	Paste
2-9	Cl	H	H	Et	Et	4-Cl	Paste
2-10	Cl	H	H	H	H	2,6-Cl ₂	126.3-127.4
2-11	Cl	H	H	H	H	2,4-Me ₂	
2-12	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-F	108.3-109.4
2-13	Cl	H	H	H	H	2-F-4-CF ₃	99
2-14	Cl	H	H	H	H	4-Ph(4-OCF ₃)	184-185
2-15	Cl	H	H	H	H	2,5-Cl ₂	99.7-101
2-16	Cl	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	98.1-99.2
2-17	Cl	H	H	Me	H	2,4-Cl ₂	Paste
2-18	Cl	H	H	Et	H	2,4-Cl ₂	Paste
2-19	Cl	H	H	Pr	H	2,4-Cl ₂	142-144
2-20	Cl	H	H	i-Pr	H	2,4-Cl ₂	93-99
2-21	Cl	H	H	Bu	H	2,4-Cl ₂	90-91
2-22	Cl	H	H	i-Bu	H	2,4-Cl ₂	Paste
2-23	Cl	H	H	Me	Me	2,4-Cl ₂	Paste
2-24	Cl	H	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	
2-25	Cl	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	88-109
2-26	Cl	Me	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	53-63
2-27	Cl	H	H	H	H	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃	123.4-124
2-28	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	

表 2(接續)

化合物 編號	X ¹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
2-29	Cl	H	H	H	H	2-F-4-CF ₃	
2-30	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
2-31	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	76-85
2-32	Cl	H	H	F	H	2,4-Cl ₂	
2-33	Cl	Me	H	F	H	2,4-Cl ₂	
2-34	CF ₃	H	H	F	H	2,4-Cl ₂	
2-35	CF ₃	Me	H	F	H	2,4-Cl ₂	
2-36	Cl	H	H	H	H	2-F-4-Cl	
2-37	Cl	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	124
2-38	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	Paste
2-39	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-Q1	137.8-139.3
2-40	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-Q2	127-129
2-41	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh	
2-42	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	
2-43	Cl	H	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	
2-44	Cl	H	H	H	H	2,4,5-F ₃	
2-45	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
2-46	Cl	Me	H	H	H	2,4-F ₂	107.6-111.9
2-47	Cl	Me	H	H	H	2-F-4-Cl	
2-48	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OH	156.8-158.3
2-49	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCH ₂ OCH ₃	
2-50	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	
2-51	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q1	137.8-139.3
2-52	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q2	127-129.1
2-53	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q3	118.4-119.7
2-54	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q4	
2-55	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q5	
2-56	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q6	
2-57	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q7	
2-58	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh	100.8-102.9
2-59	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	
2-60	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-Cl)	
2-61	Cl	Me	H	H	H	2,4,5-F ₃	
2-62	Cl	Me	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	157.4-158.9

表 2(接續)

化合物 編號	X ¹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
2-63	Cl	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	104-109
2-64	Cl	Me	H	H	H	3-OCF ₂ O-4	138.4-138.5
2-65	Cl	Me	H	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
2-66	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCF ₂ O-5	
2-67	Cl	Me	H	H	H	2-F-4-OCF ₂ O-5	
2-68	Cl	Me	Me	H	H	2,4-Cl ₂	
2-69	Cl	Me	Me	H	H	3,4-Cl ₂	
2-70	Cl	Me	Me	H	H	2,4-F ₂	
2-71	Cl	Me	Me	H	H	3,4-F ₂	
2-72	Cl	CH ₂ CH ₂		H	H	2,4-Cl ₂	
2-73	Cl	CH ₂ CH ₂		H	H	2-Cl-4-CF ₃	
2-74	Cl	CH ₂ CH ₂		H	H	2-F-4-CF ₃	
2-75	Cl	Et	H	H	H	2,4-Cl ₂	
2-76	Cl	H	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	116-117.6
2-77	Cl	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	127-129
2-78	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	131.8-132.8
2-79	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	128.4-129.5
2-80	Cl	H	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	
2-81	Cl	Me	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	
2-82	Cl	H	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	104.5-105
2-83	Cl	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	140.8-141
2-84	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-F)	108.5-109.9
2-85	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(3'-F)	Paste
2-86	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(3'-OMe)	Paste
2-87	Cl	Me	H	H	H	2-Br-4-Cl	135.0
2-88	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SMe	76.9-79.4
2-89	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SOMe	71.9-113.6
2-90	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me	117.8-119.7
2-91	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-SMe	114.1-114.2
2-92	Cl	H	H	H	H	2-Br-4-F	Paste
2-93	Cl	Me	H	H	H	2-Br-4-F	123.4-127.1



化合物 編號	X ¹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
3-1	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl	
3-2	CF ₃	H	H	H	H	3-Cl	
3-3	CF ₃	H	H	H	H	4-Cl	
3-4	CF ₃	H	H	H	H	3-CF ₃	104-106
3-5	CF ₃	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	110.2-111.2
3-6	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-F	93.1-95.7
3-7	CF ₃	H	H	H	H	2-Me-4-Cl	110.7-112.1
3-8	CF ₃	H	H	H	H	2,4-Me ₂	Paste
3-9	CF ₃	H	H	H	H	2,4-(CF ₃) ₂	102-102.7
3-10	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	118-119
3-11	CF ₃	H	H	H	H	2-F-4-CF ₃	111-113
3-12	CF ₃	H	H	H	H	2,4-F ₂	78-86
3-13	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-Br	
3-14	CF ₃	H	H	H	H	2-OCHF ₂ -4-Cl	
3-15	CF ₃	H	H	H	H	2-OPr(i)-4-Cl	108-110
3-16	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-SMe	106.3-108.0
3-17	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-SCF ₃	
3-18	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me	149.2-150.0
3-19	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ CF ₃	
3-20	CF ₃	H	H	H	H	2,5-Cl ₂	
3-21	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-5-F	
3-22	CF ₃	H	H	H	H	2-Me-5-Cl	
3-23	CF ₃	H	H	H	H	2,5-Me ₂	105.7-106.6
3-24	CF ₃	H	H	H	H	2,5-(CF ₃) ₂	
3-25	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-5-CF ₃	131-133
3-26	CF ₃	H	H	H	H	2-F-5-CF ₃	
3-27	CF ₃	H	H	H	H	2,5-F ₂	

表 3(接續)

化合物 編號	X ¹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
3-28	CF ₃	H	H	H	H	2,3-Cl ₂	
3-29	CF ₃	H	H	H	H	2,6-Cl ₂	
3-30	CF ₃	H	H	H	H	3,4-Cl ₂	114-115.2
3-31	CF ₃	H	H	H	H	3,4-(OMe) ₂	
3-32	CF ₃	H	H	H	H	3-OCF ₂ O-4	
3-33	CF ₃	H	H	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
3-34	CF ₃	H	H	H	H	3,5-Cl ₂	
3-35	CF ₃	H	H	H	H	3,5-(CF ₃) ₂	
3-36	CF ₃	H	H	H	H	3,5-F ₂	
3-37	CF ₃	H	H	H	H	2,3,4-Cl ₃	150-154
3-38	CF ₃	H	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	
3-39	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-OCH ₂ O-5	
3-40	CF ₃	H	H	Me	H	2,4-Cl ₂	
3-41	CF ₃	H	H	Et	H	2,4-Cl ₂	
3-42	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	91-95
3-43	CF ₃	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	163-164
3-43-R	CF ₃	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	184
3-43-S	CF ₃	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	183
3-44	CF ₃	Me	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	Paste
3-45	CF ₃	Me	H	F	H	2,4-Cl ₂	
3-46	CF ₃	Me	H	F	F	2,4-Cl ₂	
3-47	CF ₃	H	H	H	H	4-Ph(4'-CF ₃)	
3-48	CF ₃	H	H	H	H	4-Ph(4'-OCF ₃)	149-150
3-49	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-Ph(4'-OCF ₃)	124-125
3-50	CF ₃	H	H	H	H	2-F-4-Ph(4'-OCF ₃)	126-127
3-51	CF ₃	H	H	H	H	2-F-4-Cl	132-133
3-52	CF ₃	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	Paste
3-53	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	68.3-71.9
3-54	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-Q1	128.8-129.9
3-55	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
3-56	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh	
3-57	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	
3-58	CF ₃	H	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	127.9-130.4

表 3(接續)

化合物 編號	X ¹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
3-59	CF ₃	H	H	H	H	2,4,5-F ₃	103-105.9
3-60	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	177-178
3-61	CF ₃	Me	H	H	H	2,4-F ₂	109.2-110
3-62	CF ₃	Me	H	H	H	2-F-4-Cl	134-135.6
3-63	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-OH	159-162.4
3-64	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	137.4-140.7
3-65	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q1	177.2-178.3
3-66	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
3-67	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q3	136.6-137.5
3-68	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q4	
3-69	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q5	
3-70	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q6	
3-71	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q7	
3-72	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh	127-128.7
3-73	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	
3-74	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-Cl)	
3-75	CF ₃	Me	H	H	H	2,4,5-F ₃	125.1-127.9
3-76	CF ₃	Me	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	195.6-196.5
3-77	CF ₃	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	129
3-78	CF ₃	Me	H	H	H	3-OCF ₂ O-4	164.2
3-79	CF ₃	Me	H	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
3-80	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCF ₂ O-5	
3-81	CF ₃	Me	H	H	H	2-F-4-OCF ₂ O-5	
3-82	CF ₃	Me	Me	H	H	2,4-Cl ₂	82-85
3-83	CF ₃	Me	Me	H	H	3,4-Cl ₂	
3-84	CF ₃	Me	Me	H	H	2,4-F ₂	
3-85	CF ₃	Me	Me	H	H	3,4-F ₂	
3-86	CF ₃	CH ₂ CH ₂	H	H	H	2,4-Cl ₂	125-128
3-87	CF ₃	CH ₂ CH ₂	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
3-88	CF ₃	CH ₂ CH ₂	H	H	H	2-F-4-CF ₃	
3-89	CF ₃	Et	H	H	H	2,4-Cl ₂	169-175
3-90	CF ₃	Et	H	H	H	2,4-(CF ₃) ₂	
3-91	CF ₃	H	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	110.3-112.9

表 3(接續)

化合物 編號	X ¹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
3-92	CF ₃	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	145-147
3-93	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	132.2-132.7
3-94	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	161.4-162.5
3-95	CF ₃	H	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	
3-96	CF ₃	Me	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	Paste
3-97	CF ₃	H	H		O	2,4-Cl ₂	
3-98	CF ₃	Me	H		O	2,4-Cl ₂	
3-99	CF ₃	Me	Me		O	2,4-Cl ₂	Paste
3-100	CF ₃	Me	Me		O	3,4-Cl ₂	133.9-135.2
3-101	CF ₃	Me	Me		O	2,4,5-Cl ₃	
3-102	CF ₃	H	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	123.3-125.5
3-103	CF ₃	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	175.9-176
3-104	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-F)	128.1-133.5
3-105	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(3'-F)	113.7-117
3-106	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(3'-OMe)	100.7-103
3-107	CF ₃	Me	H	H	H	2,4-Br ₂	
3-108	CF ₃	Me	H	H	H	2-Br-4-F	
3-109	CF ₃	Me	H	H	H	2-Br-4-CF ₃	
3-110	CF ₃	Me	H	H	H	2-Br-4-OCF ₃	
3-111	CF ₃	Me	H	H	H	2-Br-4-OCHF ₂	
3-112	CF ₃	Me	H	H	H	2-Br-4-Cl-5-F	
3-113	CF ₃	Me	H	H	H	2,4-Br ₂ -5-F	
3-114	CF ₃	Me	H	H	H	2-Br-4-SCF ₃	
3-115	CF ₃	Me	H	H	H	2-Br-4-SOCF ₃	
3-116	CF ₃	Me	H	H	H	2-Br-4-SO ₂ CF ₃	
3-117	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCF ₃	
3-118	CF ₃	Me	H	H	H	2-Br-4-Cl	154
3-119	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-SOMe	101.4-103.4
3-120	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-SMe	142.4
3-121	CF ₃	H	H	H	H	2-Br-4-F	112.0
3-122	CF ₃	Me	H	H	H	2-Br-4-F	140.6-141.8
3-123	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCH ₂ CF ₃	153.1-154.0
3-124	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCH(Me) ₂	122.5

表 3(接續)

化合物 編號	X ¹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
3'-1	Cl	H	H	H	H	2-Cl	
3'-2	Cl	H	H	H	H	3-Cl	
3'-3	Cl	H	H	H	H	4-Cl	
3'-4	Cl	H	H	H	H	3-CF ₃	98-100
3'-5	Cl	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	99-100
3'-6	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-F	77-79
3'-7	Cl	H	H	H	H	2-Me-4-Cl	96.5-97.4
3'-8	Cl	H	H	H	H	2,4-Me ₂	
3'-9	Cl	H	H	H	H	2,4-(CF ₃) ₂	
3'-10	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
3'-11	Cl	H	H	H	H	2-F-4-CF ₃	107-108
3'-12	Cl	H	H	H	H	2,4-F ₂	
3'-13	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-Br	
3'-14	Cl	H	H	H	H	2-OCHF ₂ -4-Cl	
3'-15	Cl	H	H	H	H	2-OPr(i)-4-Cl	70.4-71.3
3'-16	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SMe	
3'-17	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SCF ₃	
3'-18	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me	
3'-19	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ CF ₃	
3'-20	Cl	H	H	H	H	2,5-Cl ₂	
3'-21	Cl	H	H	H	H	2-Cl-5-F	
3'-22	Cl	H	H	H	H	2-Me-5-Cl	
3'-23	Cl	H	H	H	H	2,5-Me ₂	
3'-24	Cl	H	H	H	H	2,5-(CF ₃) ₂	
3'-25	Cl	H	H	H	H	2-Cl-5-CF ₃	104-105
3'-26	Cl	H	H	H	H	2-F-5-CF ₃	
3'-27	Cl	H	H	H	H	2,5-F ₂	
3'-28	Cl	H	H	H	H	2,3-Cl ₂	
3'-29	Cl	H	H	H	H	2,6-Cl ₂	
3'-30	Cl	H	H	H	H	3,4-Cl ₂	100-102
3'-31	Cl	H	H	H	H	3,4-(OMe) ₂	83-85
3'-32	Cl	H	H	H	H	3-OCF ₂ O-4	
3'-33	Cl	H	H	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
3'-34	Cl	H	H	H	H	3,5-Cl ₂	

表 3(接續)

化合物 編號	X ¹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
3'-35	Cl	H	H	H	H	3,5-(CF ₃) ₂	
3'-36	Cl	H	H	H	H	3,5-F ₂	
3'-37	Cl	H	H	H	H	2,3,4-Cl ₃	
3'-38	Cl	H	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	
3'-39	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OCH ₂ O-5	85-87
3'-40	Cl	H	H	Me	H	2,4-Cl ₂	
3'-41	Cl	H	H	Me	Me	2,4-Cl ₂	Paste
3'-42	Cl	H	H	Et	H	2,4-Cl ₂	Paste
3'-43	Cl	H	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	Paste
3'-44	Cl	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	168
3'-45	Cl	Me	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	Paste
3'-46	Cl	Me	H	F	H	2,4-Cl ₂	
3'-47	Cl	Me	H	F	F	2,4-Cl ₂	
3'-48	Cl	H	H	H	H	4-Ph(4'-CF ₃)	
3'-49	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-Ph(4'-OCF ₃)	132-133
3'-50	Cl	H	H	H	H	2-F-4-Ph(4'-OCF ₃)	136-137
3'-51	Cl	H	H	H	H	2-F-4-Cl	
3'-52	Cl	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	Paste
3'-53	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	
3'-54	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-Q1	
3'-55	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
3'-56	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh	
3'-57	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	
3'-58	Cl	H	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	
3'-59	Cl	H	H	H	H	2,4,5-F ₃	
3'-60	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
3'-61	Cl	Me	H	H	H	2,4-F ₂	149-150
3'-62	Cl	Me	H	H	H	2-F-4-Cl	143.2-145.8
3'-63	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OH	
3'-64	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	
3'-65	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q1	183.7-184.6
3'-66	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
3'-67	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q3	
3'-68	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q4	

表 3(接續)

化合物 編號	X ¹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
3'-69	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q5	
3'-70	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q6	
3'-71	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q7	
3'-72	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh	
3'-73	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	
3'-74	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-Cl)	
3'-75	Cl	Me	H	H	H	2,4,5-F ₃	
3'-76	Cl	Me	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	
3'-77	Cl	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	
3'-78	Cl	Me	H	H	H	3-OCF ₂ O-4	
3'-79	Cl	Me	H	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
3'-80	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCF ₂ O-5	
3'-81	Cl	Me	H	H	H	2-F-4-OCF ₂ O-5	
3'-82	Cl	Me	Me	H	H	2,4-Cl ₂	
3'-83	Cl	Me	Me	H	H	3,4-Cl ₂	
3'-84	Cl	Me	Me	H	H	2,4-F ₂	
3'-85	Cl	Me	Me	H	H	3,4-F ₂	
3'-86	Cl	CH ₂ CH ₂	H	H	H	2,4-Cl ₂	
3'-87	Cl	CH ₂ CH ₂	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
3'-88	Cl	CH ₂ CH ₂	H	H	H	2-F-4-CF ₃	
3'-89	Cl	Et	H	H	H	2,4-Cl ₂	
3'-90	Cl	Et	H	H	H	2,4-(CF ₃) ₂	
3'-91	Cl	H	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
3'-92	Cl	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
3'-93	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	
3'-94	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	
3'-95	Cl	H	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	
3'-96	Cl	Me	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	
3''-1	Me	H	H	H	H	2-Cl	
3''-2	Me	H	H	H	H	3-Cl	
3''-3	Me	H	H	H	H	4-Cl	
3''-4	Me	H	H	H	H	3-CF ₃	
3''-5	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	83-91
3''-6	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-F	

表 3(接續)

化合物 編號	X ¹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
3''-7	Me	H	H	H	H	2-Me-4-Cl	
3''-8	Me	H	H	H	H	2,4-Me ₂	Paste
3''-9	Me	H	H	H	H	2,4-(CF ₃) ₂	
3''-10	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
3''-11	Me	H	H	H	H	2-F-4-CF ₃	
3''-12	Me	H	H	H	H	2,4-F ₂	
3''-13	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-Br	
3''-14	Me	H	H	H	H	2-OCHF ₂ -4-Cl	
3''-15	Me	H	H	H	H	2-OPr(i)-4-Cl	
3''-16	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-SMe	
3''-17	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-SCF ₃	
3''-18	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me	
3''-19	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ CF ₃	
3''-20	Me	H	H	H	H	2,5-Cl ₂	
3''-21	Me	H	H	H	H	2-Cl-5-F	
3''-22	Me	H	H	H	H	2-Me-5-Cl	
3''-23	Me	H	H	H	H	2,5-Me ₂	
3''-24	Me	H	H	H	H	2,5-(CF ₃) ₂	
3''-25	Me	H	H	H	H	2-Cl-5-CF ₃	
3''-26	Me	H	H	H	H	2-F-5-CF ₃	
3''-27	Me	H	H	H	H	2,5-F ₂	
3''-28	Me	H	H	H	H	2,3-Cl ₂	
3''-29	Me	H	H	H	H	2,6-Cl ₂	
3''-30	Me	H	H	H	H	3,4-Cl ₂	85.4-86.1
3''-31	Me	H	H	H	H	3,4-(OMe) ₂	
3''-32	Me	H	H	H	H	3-OCF ₂ O-4	
3''-33	Me	H	H	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
3''-34	Me	H	H	H	H	3,5-Cl ₂	
3''-35	Me	H	H	H	H	3,5-(CF ₃) ₂	
3''-36	Me	H	H	H	H	3,5-F ₂	
3''-37	Me	H	H	H	H	2,3,4-Cl ₃	
3''-38	Me	H	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	
3''-39	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-OCH ₂ O-5	
3''-40	Me	H	H	Me	Me	2,4-Cl ₂	Paste

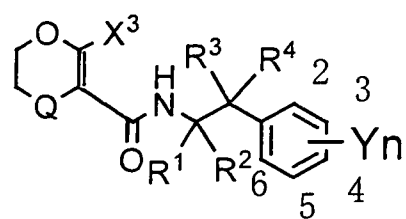
表 3(接續)

化合物 編號	X ¹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
3''-41	Me	H	H	Et	H	2,4-Cl ₂	
3''-42	Me	H	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	Paste
3''-43	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	
3''-44	Me	Me	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	
3''-45	Me	Me	H	F	H	2,4-Cl ₂	
3''-46	Me	Me	H	F	F	2,4-Cl ₂	
3''-47	Me	H	H	H	H	4-Ph(4'-CF ₃)	123-124
3''-48	Me	H	H	H	H	4-Ph(4'-OCF ₃)	122-123
3''-49	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-Ph(4'-OCF ₃)	
3''-50	Me	H	H	H	H	2-F-4-Ph(4'-OCF ₃)	85-86
3''-51	Me	H	H	H	H	2-F-4-Cl	
3''-52	Me	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
3''-53	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	
3''-54	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-Q1	
3''-55	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
3''-56	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh	
3''-57	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	
3''-58	Me	H	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	
3''-59	Me	H	H	H	H	2,4,5-F ₃	
3''-60	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
3''-61	Me	Me	H	H	H	2,4-F ₂	
3''-62	Me	Me	H	H	H	2-F-4-Cl	
3''-63	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-OH	
3''-64	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	
3''-65	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q1	
3''-66	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
3''-67	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q3	
3''-68	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q4	
3''-69	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q5	
3''-70	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q6	
3''-71	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q7	
3''-72	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh	
3''-73	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	
3''-74	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-Cl)	

表 3(接續)

化合物 編號	X ¹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
3''-75	Me	Me	H	H	H	2,4,5-F ₃	
3''-76	Me	Me	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	
3''-77	Me	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	
3''-78	Me	Me	H	H	H	3-OCF ₂ O-4	
3''-79	Me	Me	H	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
3''-80	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCF ₂ O-5	
3''-81	Me	Me	H	H	H	2-F-4-OCF ₂ O-5	
3''-82	Me	Me	Me	H	H	2,4-Cl ₂	
3''-83	Me	Me	Me	H	H	3,4-Cl ₂	
3''-84	Me	Me	Me	H	H	2,4-F ₂	
3''-85	Me	Me	Me	H	H	3,4-F ₂	
3''-86	Me	CH ₂ CH ₂		H	H	2,4-Cl ₂	
3''-87	Me	CH ₂ CH ₂		H	H	2-Cl-4-CF ₃	
3''-88	Me	CH ₂ CH ₂		H	H	2-F-4-CF ₃	
3''-89	Me	Et	H	H	H	2,4-Cl ₂	
3''-90	Me	Et	H	H	H	2,4-(CF ₃) ₂	
3''-91	Me	H	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
3''-92	Me	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
3''-93	Me	H	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	
3''-94	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	
3''-95	Me	H	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	
3''-96	Me	Me	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	
3'''-1	Br	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	125.2-126.1
3'''-2	Br	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	176.7-178
3'''-3	Br	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	
3'''-4	Br	Me	H	H	H	2,4,5-F ₃	
3'''-5	Br	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
3''''-1	I	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	160.9-161.8
3''''-2	I	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
3''''-3	I	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	
3''''-4	I	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	

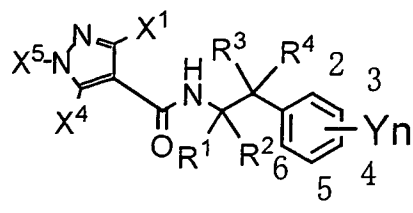
表 4



(I-4)

化合物 編號	Q	X ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Yn	性質
4-1	S	CF ₃	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	139
4-2	S	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	104
4-3	S	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
4-4	S	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
4-5	S	CF ₃	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	
4-6	S	CF ₃	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
4-7	S	CF ₃	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	
4-8	S	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	

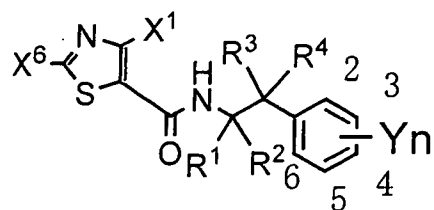
表 5



(I-5)

化合物 編號	X ¹	X ⁴	X ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
5-1	Me	H	Me	H	H	H	H	3,4-Cl ₂	131-135
5-2	Me	H	Me	H	H	H	H	3-CH=CH-CH=CH-4	103-106
5-3	Me	H	Me	H	H	H	H	3-CF ₃	Paste
5-4	Me	H	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	110-115
5-5	Me	H	Me	H	H	Et	H	2,4-Cl ₂	Paste
5-6	CF ₃	H	Me	H	H	H	H	3,4-Cl ₂	102-103
5-7	CF ₃	H	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	83-120
5-8	CF ₃	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	129
5-9	Me	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	145-150
5-10	CF ₃	H	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
5-11	I	Me	Et	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	143-144
5-12	I	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	140-141
5-13	Br	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	129-130
5-14	Cl	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	112
5-15	I	H	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	120-154
5-16	Br	H	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	145-147
5-17	Cl	H	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	155-157
5-18	CF ₃	H	Me	H	H	H	H	2-F-4-Cl	1.5062(26°C) ←
5-19	CF ₃	H	Me	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	77
5-20	Me	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	169-170
5-21	CF ₃	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	163
5-22	Me	H	Me	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	129-134
5-23	CF ₃	H	Me	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	133-134
5-24	I	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	152-188
5-25	Br	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	163-166
5-26	Cl	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	141-142
5-27	CHF ₂	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	
5-28	CHF ₂	H	Me	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
5-29	CHF ₂	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	
5-30	CHF ₂	H	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	

表 6



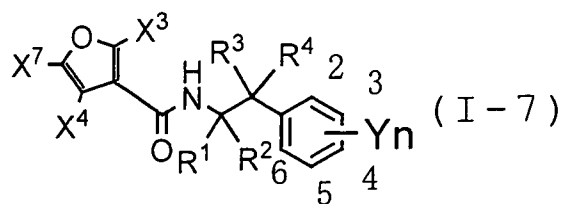
(I-6)

化合物 編號	X ¹	X ⁶	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
6-1	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	95-97
6-2	CF ₃	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	136
6-3	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Me ₂	Paste
6-4	Me	Me	H	H	H	H	3,4-Cl ₂	Paste
6-5	Me	Me	H	H	H	H	2-Me-4-Cl	Paste
6-6	Me	Me	H	H	H	H	3-CH=CH-CH=CH-4	97-99
6-7	Me	Me	H	H	H	H	2-i-Pr-4-Cl	Paste
6-8	Me	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
6-9	Me	Me	H	H	H	H	3-CF ₃	89-90
6-10	Me	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
6-11	Me	Me	H	H	H	H	2-F-4-CF ₃	115-116
6-12	Me	Me	H	H	Me	H	4-Cl	89
6-13	Me	Me	H	H	Me	Me	4-Cl	81
6-14	Me	Me	H	H	Et	H	4-Cl	Paste
6-15	Me	Me	H	H	Et	Me	4-Cl	Paste
6-16	Me	Me	H	H	Et	Et	4-Cl	Paste
6-17	Me	Me	H	H	Et	H	2,4-Cl ₂	Paste
6-18	Me	Me	H	H	n-Pr	H	2,4-Cl ₂	Paste
6-19	Me	Me	H	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	Paste
6-20	Me	Me	H	H	i-Pr	H	2,4-Cl ₂	Paste
6-21	Me	Me	H	H	i-Bu	H	2,4-Cl ₂	Paste
6-22	Me	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	154
6-23	Me	Me	Me	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	Paste
6-24	Me	Cl	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	Paste
6-25	CF ₃	Me	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	114-115
6-26	CF ₃	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	142-144
6-27	Me	Me	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	143
6-28	CF ₃	Me	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	142-143
6-29	CHF ₂	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	

表 6(接續)

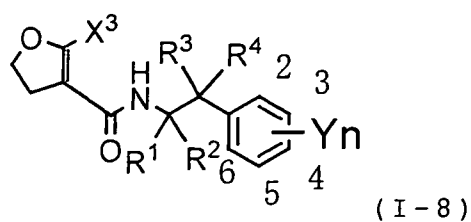
化合物 編號	X ¹	X ⁶	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
6-30	CHF ₂	Me	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
6-31	CHF ₂	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	
6-32	CHF ₂	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	

表 7



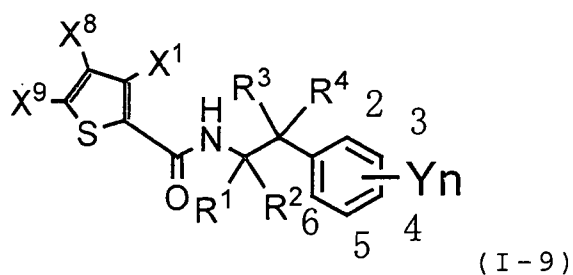
化合物 編號	X ³	X ⁴	X ⁷	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y _n	性質
7-1	Me	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	106-107°C
7-2	Me	H	H	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
7-3	CF ₃	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	
7-4	CF ₃	H	H	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
7-5	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	
7-6	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
7-7	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	
7-8	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	

表 8



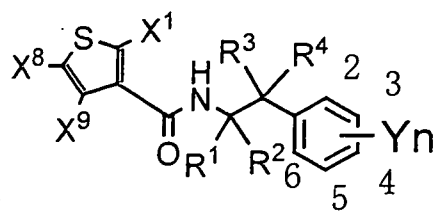
化合物 編號	X ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Yn	性質
8-1	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	
8-2	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
8-3	CF ₃	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	
8-4	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
8-5	CF ₃	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	
8-6	CF ₃	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
8-7	CF ₃	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	
8-8	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	

表 9



化合物 編號	X ¹	X ⁸	X ⁹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Yn	性質
9-1	CF ₃	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	67-70°C
9-2	I	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	81-87°C
9-3	CF ₃	H	H	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
9-4	Me	H	H	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
9-5	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	
9-6	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
9-7	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	
9-8	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	

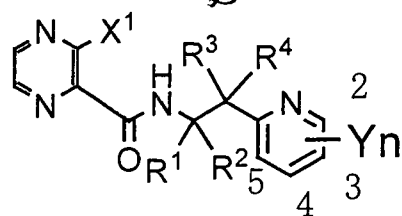
表 10



(I-10)

化合物 編號	X ¹	X ⁸	X ⁹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Yn	性質
10-1	CF ₃	H	H	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
10-2	CF ₃	H	H	H	H	H	H	2-F-4-Cl	
10-3	CF ₃	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	

表 11



(I-11)

化合物 編號	X ¹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Yn	性質
11-1	CF ₃	H	H	H	H	3-CF ₃ -5-Cl	130-131°C
11-2	CF ₃	H	H	H	H	3-Cl-5-F	
11-3	CF ₃	H	H	H	H	3,5-Cl ₂	

表 12

化合物 編號	$^1\text{H-NMR}$ [$\text{CDCl}_3/\text{TMS}, \delta$ 值 (ppm)]
1-6	7.65(dd, 1H), 7.51(m, 2H), 7.32(dd, 1H), 7.30(d, 2H), 7.14(d, 2H), 5.58(br, 1H), 3.92(m, 1H), 3.38(m, 1H), 2.80(m, 1H), 1.79(m, 1H), 1.60(m, 1H), 0.83(t, 3H)
1-7	7.65(d, 1H), 7.51(m, 2H), 7.25-7.36(m, 5H), 5.40(br, 1H), 3.77(dd, 1H), 3.59(dd, 1H), 1.80(m, 1H), 1.66(m, 1H), 1.37(s, 3H), 0.74(t, 3H)
1-8	7.65(dd, 1H), 7.51(m, 2H), 7.26-7.37(m, 5H), 5.31(br, 1H), 3.74(d, 2H), 1.75(m, 4H), 0.79(t, 6H)
1-9	7.65(dd, 1H), 7.51(m, 2H), 7.32(dd, 1H), 7.29(d, 2H), 7.15(d, 2H), 5.56(br, 1H), 3.87(m, 1H), 3.33(m, 1H), 2.98(m, 1H), 1.53(m, 2H), 1.40(m, 1H), 0.87(t, 6H)
1-13	7.81(dd, 1H), 7.27-7.34(m, 5H), 7.22(dd, 1H), 7.05(dt, 1H), 5.43(br, 1H), 3.76(dd, 1H), 3.61(dd, 1H), 1.83(m, 1H), 1.68(m, 1H), 1.41(s, 3H), 0.75(t, 3H)
1-14	7.81(dd, 1H), 7.30-7.35(m, 5H), 7.22(dd, 1H), 7.06(dt, 1H), 5.34(br, 1H), 3.75(d, 2H), 1.78(m, 4H), 0.81(t, 6H)
1-53	7.70(d, 1H), 7.58(t, 1H), 7.53(t, 1H), 7.46(d, 1H), 7.40(s, 1H), 7.39(d, 1H), 7.30(d, 1H), 5.86(br, 1H), 3.71(dd, 2H), 3.00(t, 2H), 2.44(s, 3H)
1-56	7.70(d, 1H), 7.51-7.60(m, 2H), 7.47(d, 1H), 7.30(d, 1H), 7.19(d, 1H), 7.01(dd, 1H), 6.49(t, 1H), 5.84(br, 1H), 3.72(q, 2H), 3.07(t, 2H)
1-59	7.69(d, 1H), 7.47-7.60(m, 3H), 7.36(t, 2H), 7.24(d, 1H), 7.15(t, 1H), 7.00-7.03(m, 3H), 6.88(dd, 1H), 5.85(br, 1H), 3.73(q, 2H), 3.05(t, 2H)
2-5	8.41(dd, 1H), 8.00(dd, 1H), 7.31(m, 3H), 7.20(d, 1H), 6.39(br, 1H), 3.79(m, 1H), 3.50(m, 1H), 3.11(m, 1H), 1.35(d, 3H)
2-6	8.41(dd, 1H), 8.01(dd, 1H), 7.27-7.36(m, 5H), 6.23(br, 1H), 3.69(d, 2H), 1.43(s, 6H)
2-7	8.40(dd, 1H), 7.99(dd, 1H), 7.26-7.33(m, 3H), 7.17(d, 1H), 6.32(br, 1H), 3.91(m, 1H), 3.45(m, 1H), 2.83(m, 1H), 1.80(m, 1H), 1.62(m, 1H), 0.85(t, 3H)

表 12(接續)

化合物 編號	¹ H-NMR [CDCl ₃ /TMS, δ 值 (ppm)]
2-8	8.41(dd, 1H), 8.03(dd, 1H), 7.27-7.34(m, 4H), 6.18(br, 1H), 3.79(dd, 2H), 3.62(dd, 2H), 1.85(m, 1H), 1.68(m, 1H), 1.41(s, 3H), 0.75(t, 3H)
2-9	8.41(dd, 1H), 8.05(dd, 1H), 7.29-7.35(m, 4H), 6.13(br, 1H), 3.77(d, 2H), 1.79(m, 4H), 0.80(t, 6H)
2-17	8.42(dd, 1H), 8.00(dd, 1H), 7.39(dd, 1H), 7.31(dd, 1H), 7.27(m, 2H), 6.43(br, 1H), 3.77(m, 1H), 3.65(m, 2H), 1.34(d, 3H)
2-18	8.41(dd, 1H), 7.99(dd, 1H), 7.40(d, 1H), 7.30(dd, 1H), 7.25(m, 2H), 6.36(br, 1H), 3.86(m, 1H), 3.60(m, 1H), 3.51(m, 1H), 3.84(m, 1H), 1.67(m, 1H), 0.88(t, 3H)
2-22	8.42(dd, 1H), 8.00(dd, 1H), 7.39(dd, 1H), 7.31(dd, 1H), 7.27(m, 2H), 6.36(br, 1H), 3.83(m, 1H), 3.68(m, 1H), 3.51(m, 1H), 1.64(m, 1H), 1.57(m, 1H), 1.44(m, 1H), 0.90(dd, 6H)
2-23	8.36(dd, 1H), 7.98(dd, 1H), 7.37(m, 2H), 7.28(dd, 2H), 7.22(dd, 2H), 6.26(br, 1H), 4.06(d, 2H), 1.57(s, 6H)
2-38	8.46(dd, 1H), 8.08(dd, 1H), 7.34(dd, 1H), 7.30(d, 1H), 7.20(d, 1H), 7.02(dd, 1H), 6.55(br, 1H), 6.49(t, 1H), 3.77(q, 2H), 3.10(t, 2H)
2-85	8.45(dd, 1H), 8.00(dd, 1H), 7.33(dd, 1H), 7.30(t, 1H), 7.29(d, 1H), 7.05(d, 1H), 6.90(dd, 1H), 6.83(m, 1H), 6.78(dd, 1H), 6.69-6.72(m, 1H), 6.36(d, 1H), 4.50-4.61(m, 1H), 3.07(dd, 1H), 2.99(dd, 1H), 1.35(d, 3H)
2-86	8.44(dd, 1H), 7.99(dd, 1H), 7.32(dd, 1H), 7.24(t, 2H), 7.03(d, 1H), 6.88(dd, 1H), 6.75(d, 1H), 6.58(d, 1H), 6.57(s, 1H), 6.35(d, 1H), 4.48-4.59(m, 1H), 3.79(s, 3H), 3.06(dd, 1H), 2.97(dd, 1H), 1.34(d, 3H)
2-92	8.46(dd, 1H), 8.09(dd, 1H), 7.27-7.36(m, 3H), 7.00(ddd, 1H), 6.56(br, 1H), 3.76(q, 2H), 3.10(t, 2H)
3-8	8.8(d, 1H), 8.7(d, 1H), 7.45(br, 1H), 6.9-7.1(m, 3H), 3.7(q, 2H), 2.9(t, 2H), 2.33(s, 3H), 2.30(s, 3H)
3-44	8.80(d, 1H), 8.72(d, 1H), 7.37(d, 1H), 7.32(d, 1H), 7.20(dd, 1H), 4.10(m, 1H), 1.28(m, 1H), 1.24(d, 3H), 1.02(m, 1H), 0.90(m, 1H)

表 12(接續)

化合物 編號	¹ H-NMR [CDCl ₃ /TMS, δ 值 (ppm)]
3-52	8.82(d, 1H), 8.71(d, 1H), 7.50(br, 1H), 7.40(s, 1H), 7.38(d, 1H), 7.30(d, 1H), 3.75(dd, 2H), 3.02(t, 2H), 2.44(s, 3H)
3'-41	8.49(d, 1H), 8.39(d, 1H), 7.42(d, 1H), 7.34(d, 1H), 7.24(br, 1H), 7.21(dd, 1H), 4.02(d, 2H), 1.54(s, 6H)
3'-42	8.50(d, 1H), 8.42(d, 1H), 7.47(br, 1H), 7.39(d, 1H), 7.22-7.28(m, 2H), 3.80(m, 1H), 3.58(m, 1H), 3.49(m, 1H), 1.83(m, 1H), 1.68(m, 1H), 0.87(t, 3H)
3'-43	8.52(d, 1H), 8.45(d, 1H), 7.61(br, 1H), 7.38(d, 1H), 7.28(d, 1H), 7.16(dd, 1H), 3.65(d, 2H), 1.11(dd, 2H), 0.91(dd, 2H)
3'-45	8.53(d, 1H), 8.47(d, 1H), 7.56(br, 1H), 7.37(d, 1H), 7.32(d, 1H), 7.19(dd, 1H), 4.11(m, 1H), 1.28(m, 1H), 1.23(d, 3H), 0.92(m, 1H), 0.87(m, 1H)
3'-52	8.54(d, 1H), 8.46(d, 1H), 7.73(br, 1H), 7.40(s, 1H), 7.38(d, 1H), 7.30(d, 1H), 3.71(dd, 2H), 3.01(t, 2H), 2.45(s, 3H)
3''-8	8.6(d, 1H), 8.3(d, 1H), 8.0(br, 1H), 7.1(d, 1H), 7.0(d, 1H), 6.97(dd, 1H), 3.6(q, 2H), 3.0(s, 3H), 2.9(t, 2H), 2.34(s, 3H)
3''-40	8.55(d, 1H), 8.27(d, 1H), 7.70(br, 1H), 7.42(d, 1H), 7.34(d, 1H), 7.20(dd, 1H), 3.99(d, 2H), 2.96(s, 3H), 1.54(s, 6H)
3''-42	8.58(d, 1H), 8.33(d, 1H), 7.97(br, 1H), 7.38(d, 1H), 7.28(d, 1H), 7.16(dd, 1H), 3.63(d, 2H), 2.94(s, 3H), 1.09(dd, 2H), 0.89(dd, 2H)
5-3	7.62(s, 1H), 7.4-7.5(m, 4H), 5.55(br, 1H), 3.82(s, 3H), 3.7(q, 2H), 2.98(t, 2H), 2.35(s, 3H)
5-5	7.57(s, 1H), 7.39(d, 1H), 7.20-7.29(m, 2H), 5.60(br, 1H), 3.78(s, 3H), 3.78(m, 1H), 3.45(m, 2H), 2.29(s, 3H), 1.79(m, 2H), 1.63(m, 1H), 0.85(t, 3H)
6-3	6.9-7.0(m, 3H), 5.7 (br, 1H), 3.6(q, 2H), 2.9(t, 2H), 2.7(s, 3H), 2.6(s, 3H), 2.32(s, 3H), 2.30(s, 3H)

表 12(接續)

化合物 編號	¹ H-NMR [CDCl ₃ /TMS, δ 值(ppm)]
6-4	7.39(d, 1H), 7.32(d, 1H), 7.07(dd, 1H), 5.65(br, 1H), 3.63(q, 2H), 2.88(t, 2H), 2.66(s, 3H), 2.60(s, 3H)
6-5	7.18(d, 1H), 7.13(dd, 1H), 7.07(d, 1H), 5.96(br, 1H), 3.59(q, 2H), 2.89(t, 2H), 2.67(s, 3H), 2.60(s, 3H), 2.34(s, 3H)
6-7	7.06(d, 1H), 6.88(dd, 1H), 6.87(d, 1H), 5.8(br, 1H), 4.55(m, 1H), 3.60(q, 2H), 2.86(t, 2H), 2.65(s, 3H), 2.57(s, 3H), 1.59(s, 6H)
6-14	7.32(d, 2H), 7.14(d, 2H), 5.48(br, 1H), 3.86(m, 1H), 3.30(m, 1H), 2.77(m, 1H), 2.63(s, 3H), 2.47(s, 1H), 1.77(m, 1H), 1.60(m, 1H), 0.84(t, 3H)
6-15	7.35(d, 2H), 7.27(d, 2H), 5.30(br, 1H), 3.69(dd, 1H), 3.49(dd, 1H), 2.62(s, 3H), 2.44(s, 3H), 1.82(m, 1H), 1.64(m, 1H), 1.34(s, 3H), 0.74(t, 3H)
6-16	7.35(d, 2H), 7.29(d, 2H), 5.22(br, 1H), 3.64(d, 2H), 2.62(s, 3H), 2.42(s, 3H), 1.74(q, 4H), 0.79(t, 6H)
6-17	7.41(d, 1H), 7.27(dd, 1H), 7.21(d, 1H), 5.54(br, 1H), 3.77(m, 1H), 3.47(m, 2H), 2.64(s, 3H), 2.50(s, 3H), 1.79(m, 1H), 1.65(m, 1H), 0.86(t, 3H)
6-18	7.40(d, 1H), 7.27(dd, 1H), 7.22(d, 1H), 5.52(br, 1H), 3.76(m, 1H), 3.54(m, 1H), 3.45(m, 1H), 2.64(s, 3H), 2.50(s, 3H), 1.65(m, 2H), 1.25(m, 2H), 0.88(t, 3H)
6-19	7.39(d, 1H), 7.28(d, 1H), 7.20(dd, 1H), 5.76(br, 1H), 3.57(d, 2H), 2.65(s, 3H), 2.56(s, 3H), 1.07(dd, 2H), 0.90(dd, 2H)
6-20	7.42(d, 1H), 7.27(dd, 1H), 7.21(d, 1H), 5.39(br, 1H), 3.96(m, 1H), 3.48(m, 1H), 3.27(m, 1H), 2.62(s, 3H), 2.44(s, 3H), 1.94(m, 1H), 1.11(d, 3H), 0.79(d, 3H)
6-21	7.40(d, 1H), 7.27(dd, 1H), 7.22(d, 1H), 5.53(br, 1H), 3.74(m, 1H), 3.62(m, 1H), 3.40(m, 1H), 2.64(s, 3H), 2.51(s, 3H), 1.61(m, 1H), 1.51(m, 1H), 1.41(m, 1H), 0.88(dd, 6H)
6-23	7.40(d, 1H), 7.30(d, 1H), 7.22(dd, 1H), 5.69(br, 1H), 4.00(m, 1H), 2.67(s, 3H), 2.61(s, 3H), 1.24(m, 1H), 1.19(d, 3H), 0.88-0.99(m, 3H)
6-24	7.41(d, 1H), 7.22(dd, 1H), 7.18(d, 1H), 5.78(br, 1H), 3.66(q, 2H), 3.04(t, 2H), 2.56(s, 3H)

含本發明式(I)所示之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生

物或其鹽類作為活性成分之蟲害防治劑係特別適用於水稻、果樹、蔬菜、其他作物植物及花卉與觀賞用植物之植物疾病防治，且該蟲害防治劑亦特別適用於土壤蟲害(soil pests)(例如線蟲等)之防治。

本發明植物疾病防治劑所針對之疾病係為由真菌或黴菌所引起之疾病、由細菌所引起之疾病、以及由病毒所引起之疾病，例如該防治劑係適用於防治下列疾病：由不完全真菌科(Fungi Imperfecti Family)所引起之疾病(例如，由灰黴菌屬(*Botrytis* genus)、葉枯病菌屬(*Helminthosporium* genus)、鐮孢菌屬(*Fusarium* genus)、殼針孢屬(*Septoria* genus)、尾孢菌屬(*Cercospora* genus)、小尾孢屬(*Pseudocercospora* genus)、喙孢屬(*Rhynchosporium* genus)、梨孢屬(*Pyricularia* genus)、格孢屬(*Alternaria* genus)所引起之疾病)、由擔子菌科(Basidiomycetes family)所引起之疾病(例如，由駝孢銹菌屬(*Hemileia* genus)、絲核菌屬(*Rhizoctonia* genus)、黑穗菌屬(*Ustilago* genus)、核瑚菌屬(*Typhula* genus)、銹病菌屬(*Puccinia* genus)所引起之疾病)、由子囊菌科(Ascomycetes family)所引起之疾病(例如，由黑星菌屬(*Venturia* genus)、叉絲單囊殼屬(*Podospaera* genus)、小球腔菌屬(*Leptosphaeria* genus)、布氏白粉菌屬(*Blumeria* genus)、白粉菌屬(*Erysiphe* genus)、微托菌屬(*Microdochium* genus)、核盤菌屬(*Sclerotinia* genus)、頂囊殼屬(*Gaeumannomyces* genus)、鏈核盤菌屬(*Monilinia* genus)、鉤絲殼屬(*Uncinula* genus)

所引起之疾病)、由其他不完全真菌科所引起之疾病(例如,由殼二孢屬(*Ascochyta* genus)、莖點黴屬(*Phoma* genus)、腐黴菌屬(*Pythium* genus)、優革菌屬(*Corticium* genus)、核腔菌屬(*Pyrenophora* genus)等所引起之疾病)、由細菌所引起之疾病(例如,由假單胞菌屬(*Pseudomonas* genus)、黃單胞菌屬(*Xanthomonas* genus)、伊文氏桿菌屬(*Erwinia* genus)等所引起之疾病)、或由病毒所引起之疾病(例如,由菸草鑲嵌病毒(*tobacco mosaic virus*)等所引起之疾病)等。

特定植物疾病包括,例如,水稻稻瘟病(稻熱病菌(*Pyricularia oryzae*))、水稻紋枯病(立枯絲核菌(*Rhizoctonia solani*))、水稻斑紋枯病(水稻胡麻葉斑病(*Cochiobolus miyabeanus*))、水稻立枯病(*seedling blight of rice plant*)(華根黴(*Rhizopus chinensis*))、禾生腐黴(*Pythium graminicola*)、鐮菌腐黴(*Fusarium graminicola*)、鐮菌萎凋菌(*Fusarium roseum*)、毛黴菌(*Mucor* sp.)、莖點黴菌(*Phoma* sp.)、木黴菌(*Tricoderma* sp.))、水稻惡苗病(*bakanae disease of rice plant*)(赤黴菌(*Gibberella fujikuroi*))、大麥與小麥的白粉病(布氏白粉菌(*Blumeria graminis*))、或黃瓜白粉病(瓜類白粉菌(*Sphaerotheca fuliginea*))、茄子白粉病(穀類白粉菌(*Erysiphe cichoracoarum*))等以及其他寄主植物之白粉病、大麥與小麥的眼狀斑點病(*eye spot*)(麥類基腐病菌(*Pseudocercospora herpotrichoides*))、小麥的黑穗病(*smut*)(小麥桿黑穗菌(*Urocystis tritici*))、大麥與小麥的雪

枯病(雪點微托菌(*Microdochium nivalis*)、麥類褐色雪腐菌(*Pythium iwayamai*)、雪腐小粒菌核病菌(*Typhla ishikariensis*)、褐色小粒菌核病菌(*Typhla incarnata*)、北方核盤菌(*Sclerotinia borealis*))、大麥與小麥的斑點病(禾殼鐮刀菌(*Fusarium graminearum*)、蒸麥鐮刀菌(*Fusarium avenaceum*)、黃色鐮刀菌(*Fusarium culmorum*)、雪點微托菌)、大麥與小麥的銹病(rust)(葉銹菌(*Puccinia recondita*)、黑銹菌(*Puccinia striiformis*)、桿銹菌(*Puccinia graminis*))、大麥與小麥的全蝕病(take-all)(頂囊殼白粉菌(*Gaeumannomyces graminis*))、燕麥冠腐病(燕麥冠銹菌(*Puccinia coronata*))、以及其他植物的銹病、黃瓜與草莓之灰黴病(gray mold)(灰黴菌(*Botrytis cinerea*))、蕃茄與甘藍菜之莖腐病(stem rot)(菌核菌(*Sclerotinia sclerotiorum*))、馬鈴薯與蕃茄的晚疫病(late blight)(蕃茄晚疫病(*Phytophthora infestans*))以及其他植物的晚疫病、各類植物的露菌病(downy mildew)，例如黃瓜的露菌病(黃瓜露菌病菌(*Pseudoperonospora cubensis*))、葡萄樹的露菌病(葡萄露菌病菌(*Plasmopara viticola*))等、蘋果樹的斑點病(scab)(蘋果黑星病菌(*Venturia inaequalis*))、蘋果樹的葉斑病(leaf spot)(蘋果褐色斑點病菌(*Alternaria mali*))、沙梨樹(Japanese pear tree)的黑星病(black spot)(梨墨斑病菌(*Alternaria kikuchiana*))、柑橘類果樹(citrus fruit tree)之蒂腐病(stem-end rot)(柑橘黑點病菌(*Diaporthe citri*))、柑橘類果樹之斑點病(柑橘瘡痂病菌(*Elsinoe fawcetti*))、甜菜的褐

葉斑病(甜菜褐斑病菌(*Cercospora beticola*))、花生的褐葉斑病(花生褐斑病菌(*Cercospora arachidicola*))、花生的葉斑病(花生墨澀病菌(*Cercospora personata*))、小麥的葉斑病(speckled leaf blotch)(小麥葉斑病菌(*Septoria tritici*))、小麥的穎枯病(glume blotch)(小麥穎枯病菌(*Leptosphaeria nodorum*))、大麥的腐斑病(rot blotch)(大麥網紋病菌(*Pyrenophora teres*))、大麥的葉條斑病(leaf stripe)(大麥斑葉病菌(*Pyrenophora graminea*))、大麥的灼傷病(scald)(大麥雲紋病菌(*Rhynchosporium secalis*))、小麥的裸黑穗病(loose smut)(小麥裸黑穗病菌(*Ustilago nuda*))、小麥的腥黑穗病(stinking smut)(小麥腥黑穗病菌(*Tilletia caries*))、草坪或結縷草的褐斑病(brown patch)(立枯絲核菌(*Rhizoctonia solani*))、草坪或結縷草的銀元斑病(dollar spot)(核菌病菌(*Sclerotinia homoeocarpa*))、由細菌引起之疾病，例如由假單胞菌屬所引起的疾病[例如，黃瓜的細菌性斑點病(細菌性斑點病菌(*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*))、蕃茄的細菌性凋萎病(wilt)(青枯菌(*Pseudomonas solanacearum*))及水稻的細菌性穎枯病(莢殼假單胞菌(*Pseudomonas glumae*))]、由黃單胞菌所引起的疾病[例如，甘藍菜的黑斑病(black rot)(蔬菜黑腐病菌(*Xanthomonas campestris*))、水稻之細菌性白葉枯病(leaf blight)(水稻白葉枯病菌(*Xanthomonas oryzae*))、以及柑橘類果樹的潰瘍病(canker)(柑橘潰瘍病菌(*Xanthomonas citri*))]、由伊文氏桿菌所引起的疾病[例如，甘藍菜的軟腐

病(胡蘿蔔軟腐菌(*Erwinia carotovora*))]等、由病毒所引起的疾病[例如，菸草鑲嵌病(菸草鑲嵌病毒(*Tobacco mosaic virus*))]等]等。

除此之外，該植物疾病防治劑適用於防治線蟲，例如，根腐線蟲(*root-lesion nematode*)(斯克裏布納根腐線蟲(*Pratylenchus coffeae*))、馬鈴薯包囊線蟲(*potato cyst nematode*)(黃金線蟲(*Glabodera rostchiensis*))、根瘤類線蟲(*root-knot nematode*)(根瘤線蟲(*Meloidogyne sp.*))、南方根瘤類線蟲(*southern root-knot nematode*)(南方根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*))、柑橘類線蟲(*citrus nematode*)(柑橘線蟲(*Tylenchulus semipenetrans*))、吞噬真菌性線蟲(*mycophagous nematode*)(滑刃線蟲(*Aphelenchus avenae*))、菊花葉芽類線蟲(*chrysanthemum foliar*)(菊花葉芽線蟲(*Aphelenchoides ritzemabosi*))等。

可使用本發明之蟲害防治劑之該等植物並沒有特殊限制，其包括，例如穀類植物(例如，水稻、大麥、小麥、黑麥、燕麥、玉米、高粱等)、豆科植物(大豆、紅豆、蠶豆、菜豆、花生等)、果樹與果實類(蘋果、柑橘類、梨、葡萄、桃、李子、櫻桃、胡桃、杏仁、香蕉、草莓等)、葉菜類(甘藍菜、蕃茄、菠菜、青花菜、洋萵苣、洋蔥、青蔥、青椒等)、根菜類(胡蘿蔔、馬鈴薯、甘藷、蘿蔔、蓮藕、蕪菁、等)、加工用作物(棉花、麻、構樹、結香花、油菜、甜菜根、蛇麻、甘蔗、甜菜、橄欖、橡膠、咖啡、煙草、茶等)、瓜類(南瓜、黃瓜、西瓜、甜瓜等)、牧草類(果園草、蜀黍、

梯牧草、苜蓿、紫花苜蓿等)、草坪類(韓國結縷草、糠稔草等)、香料用之作物(薰衣草、迷迭香、百里香、香芹、胡椒、薑等)、以及花卉(菊花、玫瑰花、蘭花等)。

近來，使用基因重組作物(gene recombinant crops)(抗除草劑作物(herbicide resistant crop)、具有能產生殺蟲毒素之基因之抗蟲害作物、具有能產生抗疾病誘導物質之基因之抗疾病作物、增進風味之作物、增進貯存力之作物、增進產率之作物等)、昆蟲性費洛蒙(insect sex pheromone)(用於捲葉蛾(leaf roller moths)、甘藍菜青蟲(cabbage armyworm)等的費洛蒙干擾化學物質(pheromone disrupting chemicals))、天敵昆蟲(natural enemy insect)等之綜合蟲害管理(Integrated Pest Management，簡稱作：IPM)技術已有很大的進展，本發明之蟲害防治劑亦可與此技術合併使用或系統化使用於此技術中。

當本發明之化合物係用作蟲害防治劑之活性成分時，其可無添加其他成分來使用，但較佳係在按照習知農業化學配方之加工方法加工成方便使用之農業化學配方型式後使用。

也就是說，本發明式(I)所示之 N-2-(雜)芳基乙基甲醯胺衍生物或其鹽類和視需要之佐劑係依適當比例與適合的惰性載劑摻混並透過溶解、分散、懸浮、混合、浸漬、吸收或黏附等方式製備成適合之配方型式，例如，懸浮劑、乳化濃縮劑(emulsifiable concentrate)、可溶性濃縮劑(soluble concentrate)、可溼性粉劑(wettable powder)、水分

散性粒劑(water-dispersible granule)、粒劑、粉劑(dust)、錠劑、包裝劑(pack)等。

用於本發明中之惰性載劑可為固體或液體。關於用作固體載劑之物質，可列舉者有：大豆粉、穀類細粉、木粉、樹皮粉、鋸屑、粉化煙梗、粉化胡桃殼、糠、粉化纖維素、蔬菜的萃取殘留物、樹脂(例如，粉化之合成聚合物等)、黏土(例如，高嶺土、膨土(bentonite)以及酸性黏土)、滑石(例如，滑石以及葉蠟石)、二氧化矽粉體或片狀物(例如，矽藻土、矽砂、雲母以及白碳[合成物，高分散性矽酸，亦稱作經細磨之水合二氧化矽或水合矽酸，一些商業上可購得之產品含矽酸鈣作為主要成分])、活性炭、無機或礦物粉體(例如，粉化硫黃、浮石粉、經鍛燒之矽藻土、地磚、飛灰、砂、碳酸鈣、磷酸鈣等)、塑膠載劑(例如，聚乙烯、聚丙烯、聚偏二氯乙烯等)、化學肥料(例如，硫酸銨、磷酸銨、硝酸銨、尿素以及氯化銨)以及堆肥等。該等載劑可單獨使用或以其兩種或多種混合物使用。

可用作液體載劑之物質係選自對活性成分本身即具有溶解能力之物質，或即使對活性成分不具溶解能力，但可在佐劑之輔助下分散活性成分之物質。以下為液體載劑之典型實例，其可單獨使用或以其兩種或多種混合物使用：水、醇(例如，甲醇、乙醇、異丙醇、丁醇以及乙二醇)、酮(例如，丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁基酮、二異丁基酮以及環己酮)、醚(例如，乙醚、二噁烷、2-乙氧乙醇(Cellosolve)、二丙基醚以及四氫呋喃)、脂肪族烴(例如，

煤油以及礦物油)、芳香族烴(例如, 苯、甲苯、二甲苯、溶劑油(solvent naphtha)以及烷基萘)、鹵化烴(例如, 二氯乙烷、氯仿、四氯甲烷以及氯苯)、酯(例如, 醋酸乙酯、鄰苯二甲酸二異丙酯、鄰苯二甲酸二丁酯以及鄰苯二甲酸二辛酯)、醯胺(例如, 二甲基甲醯胺、二乙基甲醯胺以及二甲基乙醯胺)、腈(例如, 乙腈)以及二甲亞砷。

以下為佐劑之典型實例, 其可依目的來使用且可單獨使用或以兩種或多種合併使用, 或者於一些情況中係不需要使用到這些佐劑。

為了乳化、分散、溶解、和/或濕潤作為活性成分之化合物, 則係使用界面活性劑。關於界面活性劑, 可列舉者有: 聚氧伸乙基烷基醚、聚氧伸乙基烷基芳基醚、聚氧伸乙基高級脂肪酸酯、聚氧伸乙基樹脂酸酯、聚氧伸乙基山梨醇酐單月桂酸酯、聚氧伸乙基山梨醇酐單油酸酯、烷芳基磺酸酯、萘磺酸的縮合物、木質素磺酸鹽(ligninsulfonate)以及高級醇硫酸酯。

再者, 為了安定作為活性成分之化合物分散液、使其增加黏性和/或使其黏結, 則亦可使用以下所列舉之佐劑, 亦即可使用的佐劑有, 例如: 酪蛋白、明膠、澱粉、甲基纖維素、羧甲基纖維素、阿拉伯膠、聚(乙烯醇)、松節油、米糠油、膨土以及木質素磺酸鹽。

為了促進固體產物之可流動性, 則亦可使用以下之佐劑, 亦即可使用的佐劑有, 例如: 蠟、硬脂酸酯、磷酸烷酯等。

如萘磺酸之縮合產物以及磷酸酯的聚縮合物之佐劑可用作分散產物之解膠劑。

如矽油之佐劑亦可用作除泡劑。

亦可添加如 1,2-苯并異噻唑啉-3-酮、對-氯-間-二甲酚、對-羥苯甲酸丁酯之佐劑作為防腐劑。

再者，若有必要，則亦可添加功能性擴展劑、活性增強劑(例如，代謝分解抑制劑，如胡椒基丁氧化物)、抗凍劑(例如丙二醇)、抗氧化劑(例如，BHT)、紫外線吸收劑以及其他添加劑。

若有需要，則可改變作為活性成分之化合物之含量，且該作為活性成分之化合物可在每 100 重量份蟲害防治劑之 0.01 至 90 重量份的範圍內選擇適當比例予以使用。例如，於乳化濃縮劑、可溼性粉劑、粉劑或粒劑中，該作為活性成分之化合物之適當含量為 0.01 至 50 重量%。

為了防治各式各樣的蟲害，本發明之蟲害防治劑可直接施用，或經水或類似物適當稀釋或懸浮於水或類似物中之後再施用。本發明蟲害防治劑的施用劑量係依各類因素(例如，用途、欲防治之蟲害、植物的生長狀況、蟲害相之傾向、氣候、環境條件、配方型式、施用的方法、施用的部位以及施用的時間)而改變。依照其用途，每 10 公畝中(就作為活性成分之化合物而論)可適當選用在 0.001g 至 10kg，較佳在 0.01g 至 1kg 的範圍內之蟲害防治劑。

為了防治各式各樣的蟲害，使用於本發明方法中的蟲害防治劑，可經由習知方法(例如該等施用於水稻育苗箱

(nursery box)、種子拌藥(seed dressing)等之施用方法，以及例如種子消毒法、栽培穴施用法(planting pit application)、作物根部施用法(plant foot application)、栽培列施用法(Planting-row application)、土壤混拌法(soil incorporation)等之施用方法)，以其本身或經水或類似物適當稀釋或懸浮於水或類似物中之後，以防治蟲害的有效量施用在預期會出現蟲害的目標植物的種子上或施用在供播種用的培植載體(cultivation carrier)上等。對於作物(例如，果樹、穀類、蔬菜等)所患的植物疾病，該防治劑可藉由下列方式施用：種子的處理(例如拌藥(dressing)、浸藥(dipping)等)、育苗根部的浸藥處理、育苗基的土壤注入(例如，於播種時之栽培列等、育苗用的栽培箱、栽培穴、作物根部等)、在表面拌藥之後澆水、摻混處理等，藉此使植物吸收該防治劑。該蟲害防治劑可用於處理水耕法(hydroponic culture)所用之水培養基(water culture medium)。

至於種子的處理方法，可列舉習知的方法，例如，包含將種子浸於藉由稀釋或未稀釋液體配方或稀釋固體配方所得之液體防治劑中之防治劑浸入法、包含藉由使種子與配方混合或進行拌藥等而將固體配方或液體配方黏附於種子表面之方法、包含用高黏性載劑(例如，樹脂、聚合物等)與配方混合並在種子上形成單層或多層塗層之方法、以及包含種植時同時施用在靠近種子附近之方法。

上述欲進行種子處理之「種子」，廣義而言，於本發明

中其意義與“繁殖用之植物體”同義，其包括凡稱作種子者與營養繁殖用之植物體，例如球莖、塊莖、種薯(seed potato)、鱗莖、扦插繁殖用之莖等。

實施本發明之方法時，所述「土壤」或「培植載體」意指栽培植物用之支持體，而其材質並沒有特別限制。只要植物能生長於其中，則任何材質(包括例如，各種土壤、育苗床、水等)皆可。除此之外，砂、蛭石(vermiculite)、棉花、紙、矽藻土、瓊脂、凝膠狀物質、聚合物、岩綿、玻璃綿、木片、樹皮、浮石等亦皆可使用。

至於施用於土壤之方法，可列舉如：包含將用水或未用水稀釋之液體或固體配方施用在植物體、播種用之育苗等附近之方法；包含以粒劑施用在植物體或育苗附近之方法；包含在播種或移植之前，與可溼性粉劑、水分散性粒劑、粒劑等一起施用，使其進入全部土壤中之方法；包含在播種或種植之前，以粉劑、可溼性粉劑、水分散性粒劑、粒劑等施用於栽培穴、栽培列等之方法；等。

於水稻育苗箱的例子中，該劑型可依，例如，播種時施用、綠化期施用、移植期施用等施用時期而異。然而，粉劑、水分散性粒劑、粒劑等劑型則皆可使用。

亦可能藉由混入培養土(grove soil)中而進行施用，其中該培養土係與粉劑、水分散性粒劑、粒劑等混合，例如，可採用床土混合、覆土混合、培養土整體混合等。

或者，培養土與各種配方可以交互層形式施用。播種時施用之時間可為在播種前、與播種同時、以及播種之後

之任一者。除此之外，覆土之後施用亦可行。

對旱地作物(upland crops)(例如，小麥等)而言，在播種至育苗(raising seedling)時期間對種子、欲放置在靠近植物體之培植載體等進行處理係為較佳者。對欲直接播種於田地的植物而言，對種子的直接處理、栽種時對欲放置於靠近植物的培植載體之處理係為較佳者。以粒劑進行施用、使用以水稀釋或未經水稀釋之液體製劑的土壤注入處理等亦為可能者。

對欲移植之栽培植物在播種或育苗期之處理，可施用種子的直接處理、以液體製劑進行育苗用苗床之土壤灌注處理、或以粒劑進行其分散處理。此外，定植(fix planting)時可以粒劑處理栽培穴，或可以粒劑混合在欲放置於移植處附近之培植載體。

為了擴大可防治的蟲害種類的範圍與可有效施用的期間或降低劑量，本發明之蟲害防治劑可與其他殺真菌劑、殺蟲劑、殺蟎劑(acaricide)、殺線蟲劑、生物除害劑(biotic pesticides)等混合使用。此外，本發明之農園藝殺蟲劑(agrohorticultural insecticide)可依照施用狀況與除草劑、植物生長調節劑(plant growth regulator)、肥料等混合使用。

至於用於上述目的之其他殺真菌劑，可列舉諸如以下之殺真菌劑：硫磺、石硫合劑(lime sulfur)、鹼式硫酸銅(copper sulfate basic)、丙基喜樂松(Iprobenfos)、敵瘟磷(Edifenfos)、脫克松(Tolclofos-methyl)、福美肅(Thiram)、

代森福美鋅 (Polycarbamate)、鋅乃浦 (Zineb)、錳乃浦 (Maneb)、鋅錳乃浦 (Mancozeb)、甲基鋅乃浦 (Propineb)、多保淨 (Thiophanate)、甲基多保淨 (Thiophanate-methyl)、免賴得 (Benomyl)、亞胺八阿特寧醋酸酯 (Iminoctadin acetate)、亞胺八阿特寧雅貝環酸酯 (Iminocutadin albeylate)、滅普寧 (Mepronil)、福多寧 (Flutolanil)、賓克隆 (Pencycuron)、呋喃乙匹利 (Furametpyl)、賽氟滅 (Thifluzamide)、滅達樂 (Metalaxyl)、毆殺斯 (Oxadixyl)、加普胺 (Carpropamid)、益發靈 (Dichlofluanid)、氟硫滅 (Flusulfamide)、四氯異苯 (Chlorothalonil)、克收欣 (Kresoxim-methyl)、禾草靈 (Fenoxanil)、喜美舍唑 (Himexazol)、依得利 (Etridiazol)、唑呋草 (Fluoroimide)、撲滅寧 (Procymidone)、免克寧 (Vinclozolin)、依普同 (Iprodione)、三泰芬 (Triadimefon)、比多農 (Bitertanol)、賽福座 (Triflumizole)、種菌唑 (Ipconazole)、氟康唑 (Fluconazole)、普克利 (Propiconazole)、二苯康唑 (Diphenconazole)、邁克尼 (Myclobutanil)、四克利 (Tetraconazole)、菲克利 (Hexaconazole)、得克利 (Tebuconazole)、賽德林 (Thiadinil)、易胺座 (Imibenconazole)、撲克拉 (Prochloraz)、披扶座 (Pefurazoate)、環克座 (Cyproconazole)、亞賜圃 (Isoprothiolane)、芬瑞莫 (Fenarimol)、施佳樂 (Pyrimetanil)、滅派林 (Mepanipyrim)、比芬諾 (Pyrifenoxy)、扶吉胺 (Fluazinam)、賽福寧 (Triforine)、達滅淨

(Diclomezine)、亞托敏(Azoxystrobin)、噻二肼(Thiadiazin)、蓋普丹(Captan)、撲殺熱(Probenazole)、阿拉酸式苯-S-甲基(Acibenzolar-S-methyl)、熱必斯(Fthalide)、三賽唑(Tricyclazole)、百快隆(Pyroquilon)、螞離丹(Chinomethionat)、歐索林酸(Oxolinic acid)、腈硫醌(Dithianon)、嘉賜黴素(Kasugamycin)、維利黴素(Validamycin)、保粒黴素(Polyoxin)、保米黴素(Blasticidin)、鏈黴素(Streptomycin)等。

至於用於如上述相同目的者之殺蟲劑、殺蟎劑、殺線蟲劑，可列舉諸如以下之殺蟲劑、殺蟎劑、殺線蟲劑：愛殺松(Ethion)、三氯松(Trichlorfon)、甲胺磷(Metamidophos)、毆殺松(Acephate)、二氯松(Dichlorvos)、美文松(Mevinphos)、亞素靈(Monocrotophos)、馬拉松(Malathion)、大滅松(Dimethoate)、福木松(Formothion)、滅加松(Mecarbam)、繁米松(Vamidotion)、硫滅松(Thiometon)、二硫松(Disulfoton)、異亞砒磷(Oxydeprofos)、乃力松(Naled)、甲基巴拉松(Methylparathion)、撲滅松(Fenitrothion)、氰乃松(Cyanophos)、加護松(Propaphos)、芬殺松(Fenthion)、普硫松(Prothiofos)、佈飛松(Profenofos)、亞芬松(Isofenphos)、亞培松(Temephos)、賽達松(Phenthoate)、甲基毒蟲畏(Dimethylvinphos)、克芬松(Chlorfenvinphos)、殺蟲畏(Tetrachlorvinphos)、巴賽松(Phoxim)、加福松(Isoxathion)、白克松(Pyraclufos)、滅大松(Methidathion)、

陶斯松 (Chlorpyrifos)、甲基陶斯松 (Chlorpyrifos-methyl)、
 必芬松 (Pyridaphenthion)、大利松 (Diazinon)、亞特松
 (Pirimiphosmethyl)、裕必松 (Phosalone)、益滅松
 (Phosmet)、二氧雜苯松 (Dioxabenzophos)、拜裕松
 (Quinalphos)、特布松 (Terbuphos)、普伏松 (Ethoprophos)、
 硫線磷 (Cadusafos)、美硫瘟磷 (Mesulfenfos)、
 DPS (NK-0795)、蔓草磷 (Phosphocarb)、芬滅松
 (Fenamiphos)、異胺松 (Isoamidophos)、福賽絕
 (Fosthiazate)、氯唑磷 (Isazophos)、普伏松 (Ethoprophos)、
 芬殺松 (Fenthion)、福斯坦 (Fostietane)、除線磷
 (Dichlofenthion)、蟲線磷 (Thionazin)、硫丙磷 (Sulprofos)、
 繁福松 (Fensulfothion)、二胺松 (Diamidafos)、除蟲菊酯
 (Pyrethrin)、丙烯除蟲菊酯 (Allethrin)、普亞列寧
 (Prallethrin)、異列滅寧 (Resmethrin)、百滅寧 (Permethrin)、
 七氟菊酯 (Tefluthrin)、畢芬寧 (Bifenthrin)、芬普寧
 (Fenpropathrin)、賽滅寧 (Cypermethrin)、 α -賽滅寧
 (α -Cypermethrin)、賽洛寧 (Cyhalothrin)、 λ -賽洛寧
 (λ -Cyhalothrin)、第滅寧 (Deltamethrin)、阿納寧
 (Acrinathrin)、芬化利 (Fenvalerate)、益化利
 (Esfenvalerate)、乙氟菊酯 (Cycloprothrin)、依芬寧
 (Ethofenprox)、合芬寧 (Halfenprox)、矽護芬 (Silaflofen)、
 護賽寧 (Flucythrinate)、福化利 (Fluvalinate)、滅多威
 (Methomyl)、毆殺滅 (Oxamyl)、硫敵克 (Thiodicarb)、得滅
 克 (Aldicarb)、棉鈴威 (Alanycarb)、培丹 (Cartap)、必芬治

(Metolcarb)、滅爾蝨(Xylylcarb)、安丹(Propoxur)、苯氧克(Phenoxycarb)、丁基滅必蝨(Fenobucarb)、愛殺苯克(Ethiophencarb)、芬硫克(Fenothiocab)、聯苯胼酯(Bifenazate)、BPMC(2-第二丁基-苯基-N-甲基胺基甲酸酯、加保利(Carbaryl)、比加普(Pirimicarb)、加保扶(Carbofuran)、丁基加保扶(Carbosulfan)、呔線威(Furathiocarb)、免扶克(Benfuracarb)、亞多西克(Aldoxycarb)、汰芬隆(Diafenthiuron)、二福隆(Diflubenzuron)、得福隆(Teflubenzuron)、六伏隆(Hexaflumuron)、諾伐隆(Novaluron)、祿芬隆(Lufenuron)、氟芬隆(Flufenoxuron)、克福隆(Chlorfluazuron)、芬佈賜(Fenbutatin oxide)、氫氧化三環己基錫(Tricyclohexyltin hydroxide)、油酸鈉、油酸鉀、烯蟲酯(Methoprene)、烯蟲乙酯(Hydroprene)、百蹠克(Binapacryl)、三亞蹠(Amitraz)、大克蹠(Dicofol)、凱洛森(Kersen)、克氯苯(Chlorobenzilate)、溴蹠酯(Phenisobromolate)、得克蹠(Tetradifon)、免速達(Bensultap)、西脫蹠(Benzoximate)、得芬諾(Tebufenozide)、滅芬諾(Methoxyfenozide)、啖蟲丙醚(Pyridalyl)、滅達福明隆(Metaflumizone)、氟蟲胺(Flubendiamide)、環蟲醯胼(Chromafenozide)、毆蹠多(Propargite)、愛斯達諾斯利(Acequinosyl)、安殺番(Endosulfan)、敵殺磷(Diofenolan)、氯芬奈皮(Chlorfenapyl)、芬普蹠(Fenpyroximate)、啖蟲醯胺(Tolfenpyrad)、芬普尼(Fipronil)、吡蹠胺(Tebufenpyrad)、

啞 蚜 威 (Triazamate)、依 殺 蟎 (Etoxazole)、合 賽 多 (Hexythiazox)、硫 酸 菸 鹼 (Nicotine sulfate)、烯 啞 蟲 胺 (Nitenpyram)、亞 滅 培 (Acetamiprid)、賽 果 培 (Thiacloprid)、益 達 胺 (Imidacloprid)、賽 速 安 (Thiamethoxam)、可 尼 丁 (Clothianidin)、達 特 南 (Dinotefuran)、扶 吉 胺 (Fluazinam)、百 利 普 芬 (Pyriproxyfen)、愛 美 松 (Hydramethylnon)、畢 汰 芬 (Pyrimidifen)、畢 達 本 (Pyridaben)、賽 滅 淨 (Cyromazine)、TPIC(異 氰 酸 三 丙 酯)、百 米 啞 胼 (Pymetrozin)、克 落 芬 (Clofentezin)、布 芬 非 定 (Buprofedin)、硫 賜 安 (Thiocyclam)、芬 殺 蟎 (Fenazaquin)、滅 蟎 猛 (Chinomethionate)、因 得 克 (Indoxacarb)、瀏 陽 霉 素 錯 合 物 (Polynactin complexes)、密 滅 汀 (Milbemectin)、阿 巴 汀 (Abamectin)、甲 胺 基 阿 維 菌 素 苯 甲 酸 鹽 (Emamectin-benzoate)、史 賓 諾 斯 (Spinosad)、蘇 力 菌 (Bacillus thuringiensis, 簡 稱 作 : BT)、印 棟 素 (Azadirachtin)、魚 藤 精 (Rotenone)、羥 丙 基 澱 粉 (Hydroxypropyl starch)、鹽 酸 左 旋 咪 啞 (Levamisole hydrochloride)、斯 美 地 (Metam-sodium)、摩 朗 得 酒 石 酸 鹽 (Morantel tartrate)、邁 隆 (Dazomet)、水 楊 菌 胺 (Trichlamide)、巴 斯 德 芽 菌 (Pasteuria)、瘤 捕 單 頂 孢 (Monacrosporium-phymatophagum)等。

同 樣 地，至 於 除 草 劑，可 列 舉 諸 如 以 下 之 除 草 劑：嘉 磷 塞 (Glyphosate)、硫 復 松 (Sulfosate)、草 甘 膦 (Glyfosinate)、畢 拉 草 (Bialaphos)、抑 草 磷 (Butamifos)、戊

草丹 (Esprocarb) 、 普 速 丹 (Prosulcarb) 、 殺 滅 丹 (Benthiocarb) 、 稗 草 丹 (Pyributycarb) 、 亞 速 爛 (Asulam) 、 理 有 龍 (Linuron) 、 汰 草 龍 (Dymron) 、 愛 速 隆 (Isouron) 、 免 速 隆 (Bensulfuron methyl) 、 環 磺 隆 (Cyclosulfamuron) 、 西 速 隆 (Cinosulfuron) 、 噻 磺 隆 (Pyrazosulfuron ethyl) 、 四 唑 噻 磺 隆 (Azimsulfuron) 、 依 速 隆 (Imazosulfuron) 、 坦 利 克 (Tenylchlor) 、 拉 草 (Alachlor) 、 普 拉 草 (Pretilachlor) 、 克 普 草 (Clomeprop) 、 乙 氧 苯 草 胺 (Etobenzanid) 、 滅 芬 草 (Mefenacet) 、 施 得 圃 (Pendimethalin) 、 比 芬 諾 (Bifenox) 、 亞 喜 芬 (Acifluorfen) 、 拉 提 芬 (Lactfen) 、 丁 基 賽 伏 草 (Cyhalofop-butyl) 、 碘 苯 腈 (Ioxynil) 、 溴 芬 諾 (Bromobutide) 、 亞 汰 草 (Alloxydim) 、 喜 托 錠 (Setoxydim) 、 滅 落 脫 (Napropamide) 、 節 草 酮 (Indanofan) 、 唑 特 (Pyrazolate) 、 吡 草 酮 (Benzofenap) 、 霸 草 靈 (Pyraflufen-ethyl) 、 依 美 皮 (Imazapyl) 、 甲 磺 草 胺 (Sulfentrazone) 、 唑 草 胺 (Cafenstrole) 、 環 戊 惡 草 酮 (Bentoxazon) 、 樂 滅 草 (Oxadiazon) 、 巴 拉 刈 (Paraquat) 、 大 刈 特 (Diquat) 、 噻 草 醚 (Pyriminobac) 、 西 瑪 津 (Simazine) 、 草 脫 淨 (Atrazine) 、 愛 落 殺 (Dimethametryn) 、 三 疊 氮 福 安 (Triazyflam) 、 苯 福 勒 斯 特 (Benflesate) 、 福 特 阿 特 - 甲 基 (Flutiacet-methyl) 、 快 伏 草 (Quizalofop-ethyl) 、 本 達 隆 (Bentazon) 、 過 氧 化 鈣 等 。

[實施例]

本發明係藉由參照實施例予以詳盡說明，只要該等實

施例不偏離本發明之範疇，則該等實施例皆不擬對本發明構成限制。

[實施例 1]N-[2-(2,4-二氯-苯基)-1-甲基乙基]-2-三氟甲基苯甲醯胺(第 1-32 號化合物)之製備

(1-1)將 2,4-二氯苯甲醛(1.45 克，8.3 毫莫耳)、醋酸銨(0.64 克，8.3 毫莫耳)以及硝基乙烷(6 克，80 毫莫耳)之混合物加熱回流 6 小時。將該混合物冷卻至室溫並加入醋酸乙酯。用水和飽和鹽水洗滌該混合物，之後以無水硫酸鎂乾燥該混合物，且隨後濃縮該混合物。將經濃縮之該混合物用乙醇再結晶獲得 2,4-二氯-1-(2-硝基-1-丙烯基)苯(黃色針狀結晶，產率，1.0 克，52%)。

(1-2)於室溫下，將含 2,4-二氯-1-(2-硝基-1-丙烯基)苯(1.0 克，4.3 毫莫耳)的四氫呋喃(5 毫升)溶液滴加至含氫化鋰鋁(0.33 克，8.9 毫莫耳)的四氫呋喃(20 毫升)懸浮液中。緩慢地開始回流，之後使該混合物加熱回流 1 小時。將該混合物冷卻至室溫並於冰浴槽冷卻下加入水(2 毫升)。加入 1N 的氫氧化鈉水溶液(5 毫升)並以矽藻土(celite)過濾移除不溶之物質。將水加入至濾液中，並用甲基第三丁基醚萃取該混合物。以飽和鹽水洗滌該有機層，並用無水硫酸鎂乾燥之，並濃縮而得到粗[2-(2,4-二氯苯基)-1-甲基乙基]胺(產率；0.8 克，91%)。

性質： $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ 值(ppm)] 7.38(d, 1H), 7.18(d, 1H), 7.17(s, 1H), 3.24(m, 1H), 2.80(dd, 1H), 2.65(dd, 1H), 1.23(d, 3H)。

(1-3)於室溫下，將 2-三氟甲基苯甲醯氯(0.8 克，3.8 毫莫耳)緩慢滴加至含粗 [2-(2,4-二氯苯基)-1-甲基乙基]胺(約 0.8 克，3.9 毫莫耳)與三乙胺(0.6 克，5.9 毫莫耳)的四氫呋喃(20 毫升)溶液中。於室溫下攪拌 0.5 小時之後，加入水並用醋酸乙酯萃取該混合物。將該有機層以 0.5N 鹽酸、飽和碳酸氫鈉水溶液以及飽和鹽水洗滌，並用無水硫酸鎂乾燥並濃縮該有機層。使用矽膠管柱層析法純化該殘餘物並用丙酮/正己烷的混合溶劑再結晶，以獲得所欲之化合物(白色固體，產率：0.4 克，27%)。

性質：熔點為 142°C。

[實施例 2]N-[2-(2,4-二氯苯基)-1-甲基乙基]-2-三氟甲基吡啶-3-甲醯胺(第 3-43 號化合物)之製備

將 1-乙基-3-(3-二甲基胺基丙基)碳二亞胺鹽酸鹽(0.3 克，1.6 毫莫耳)加入至含 2-三氟甲基吡啶-3-羧酸(0.25 克，1.3 毫莫耳)、[2-(2,4-二氯苯基)-1-甲基乙基]胺(0.27 克，1.3 毫莫耳)以及 4-二甲基胺基吡啶(0.19 克，1.6 毫莫耳)的氯仿(10 毫升)溶液中並於室溫攪拌該混合物 12 小時。在加入水和氯仿之後，該混合物分層，依序用水和飽和鹽水洗滌該有機層並用無水硫酸鈉乾燥之。於減壓下濃縮該混合物並用矽膠管柱層析法(己烷：醋酸乙酯 = 2 : 1)純化該殘餘物以獲得所欲之化合物(產率：0.31 克，63%)。

性質：熔點為 163 至 164°C。

[實施例 3]N-{1-[1-(2,4-二氯苯基)環丙基]乙基}-2-氯吡啶-3-甲醯胺(第 3'-45 號化合物)之製備

(3-1)於室溫下，將溴化甲鎂(0.96 莫耳/升四氫呋喃溶液，30 毫升)加入至含 1-(2,4-二氯苯基)環丙烷甲腈(5.0 克，23.6 毫莫耳)的四氫呋喃(20 毫升)溶液中。將該混合物加熱回流 1.5 小時之後，使該混合物冷卻至室溫，並於冰浴槽冷卻下加入 0.5M 的鹽酸。使用無水硫酸鎂乾燥經醋酸乙酯萃取的有機層並濃縮以得到粗 1-[1-(2,4-二氯苯基)環丙基]乙酮(棕色油狀，產率：3.4 克，63%)。

(3-2)將 1-[1-(2,4-二氯苯基)環丙基]乙酮(3.4 克，14.8 毫莫耳)、羥胺鹽酸鹽(2.8 克)、三乙胺(3.8 克)以及乙醇(30 毫升)的混合物加熱回流 8 小時。使該混合物冷卻至室溫，蒸除乙醇並加入醋酸乙酯。使用水和飽和鹽水洗滌之後，以無水硫酸鎂乾燥該有機層並濃縮之。使用矽膠管柱層析法純化該殘餘物以獲得 1-[1-(2,4-二氯苯基)環丙基]乙酮肟(白色固體，產率：3.4 克，94%)。

(3-3)於室溫用氫氣加壓下，將 1-[1-(2,4-二氯苯基)環丙基]乙酮肟(2.6 克，10.7 毫莫耳)、雷氏鎳 (Raney Nickel) (2.0 克)以及乙醇(30 毫升)的混合物攪拌 30 小時。藉由矽藻土過濾將雷氏鎳移除並將濾液濃縮。將醋酸乙酯加入至殘餘物中並用水和飽和鹽水洗滌該混合物。使用無水硫酸鎂乾燥該有機層並濃縮之以得到粗 1-[1-(2,4-二氯苯基)環丙基]乙胺(棕色油狀)。

性質： $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ 值 (ppm)] 7.37(d, 1H), 7.29(d, 1H), 7.18(dd, 1H), 2.87(q, 1H), 1.05(d, 3H), 0.96(br, 2H), 0.80(d, 2H)。

將該粗產物溶於甲基第三丁基醚(20 毫升)中並將含於醋酸乙酯中的 4N 鹽酸溶液滴加至其中。過濾該白色沈澱物，以甲基第三丁基醚洗滌並風乾，以獲得 1-[1-(2,4-二氯苯基)環丙基]乙胺鹽酸鹽(白色固體，產率：2.0 克)。

性質： $^1\text{H-NMR}$ [$\text{CDCl}_3/\text{TMS}, \delta$ 值 (ppm)] 8.35(br, 3H), 7.45(d, 1H), 7.39(d, 1H), 7.19(dd, 1H), 3.36(br, 1H), 1.37(d, 3H), 1.25-1.39(m, 2H), 1.03(m, 1H), 0.96(m, 1H)。

(3-4) 將 1-乙基-3-(3-二甲基胺基丙基)碳二亞胺鹽酸鹽(0.22 克，1.2 毫莫耳)加入至含 2-氯吡啶-3-羧酸(0.15 克，1.0 毫莫耳)、1-[1-(2,4-二氯苯基)環丙基]乙胺鹽酸鹽(0.25 克，0.94 毫升)以及 4-二甲基胺基吡啶(0.29 克，2.4 毫莫耳)的氯仿(10 毫升)溶液中並於室溫攪拌該混合物 12 小時。在加入水和氯仿之後，該混合物會分層，依序用水和飽和鹽水洗滌該有機層並用無水硫酸鈉乾燥之。於減壓下濃縮該混合物並用矽膠管柱層析法(己烷：醋酸乙酯 = 3 : 1)純化該殘餘物以獲得所欲之化合物(產率：0.24 克，69%)。

性質： $^1\text{H-NMR}$ [$\text{CDCl}_3/\text{TMS}, \delta$ 值 (ppm)]: 8.53(d, 1H), 8.47(d, 1H), 7.55(br, 1H), 7.37(d, 1H), 7.32(d, 1H), 7.19(dd, 1H), 4.11(m, 1H), 1.28(m, 1H), 1.23(d, 3H), 1.01(m, 1H), 0.90(m, 2H)。

以下將描述本發明之典型配方例以及試驗例，而該等實施例並非用來解釋成限制本發明之範疇。

實施例中所使用之術語「份(“part”及“parts”)」意指重量份。

[配方例 1]

本發明之化合物	10 份
二甲苯	70 份
N-甲基吡咯啉酮	10 份
聚氧伸乙基壬基苯基醚和烷基苯磺酸鈣的混合物	10 份

藉由均勻混合上述諸成分至有效溶解而製備乳化濃縮劑。

[配方例 2]

本發明之化合物	3 份
黏土粉末	82 份
矽藻土粉末	15 份

藉由均勻混合並研磨上述諸成分而製備粉劑。

[配方例 3]

本發明之化合物	5 份
膨土與黏土之混合粉末	90 份
木質素磺酸鈣	5 份

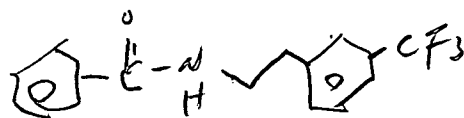
藉由均勻混合上述諸成分，並用適量之水與所得之混合物揉合在一起，之後經造粒並乾燥而製備粒劑。

[配方例 1]

本發明之化合物	20 份
高嶺土與人造高分散性矽酸之混合物	75 份
聚氧伸乙基烷壬基苯基醚和烷基苯磺酸鈣的混合物	5 份

藉由均勻混合並研磨上述諸成分而製備可溼性粉劑。

以下的試驗例顯示出以本發明之化合物當作蟲害防治劑，尤其是植物疾病防治劑或殺線蟲劑之效用。本發明之化合物係以表 1 至表 11 中所述之化合物編號表示。至於比較用之對照組化合物，係使以下四種化合物進行相似之評估。

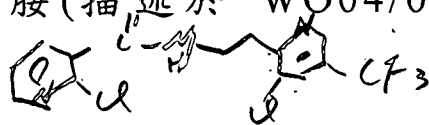


比較化合物 A: 2,6-二氯-N-[2-{3-(三氟甲基)苯基}乙基]甲醯胺(描述於 JP-A-1-151546 中之第 12 號化合物)

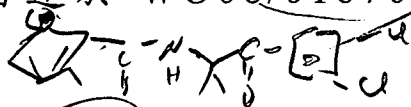
比較化合物 B: N-{2-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]乙基}-2-三氟甲基苯甲醯胺(描述於 WO04/016088 中之第 A-20 號化合物)



比較化合物 C: N-{2-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]乙基}-2-氯吡啶-3-甲醯胺(描述於 WO04/074280 中之第 R-1 號化合物)



比較化合物 D: N-[3',4'-二氯-(1,1-二甲基)苯甲醯甲基]-3-甲基-2-噁吩甲醯胺(描述於 WO06/016708 中之第 1-20 號化合物)



[試驗例 1] 對抗蘋果樹斑點病的防治效果之試驗

將生長於花盆中的蘋果樹(品種: Ohrin)幼苗用依照配方例 1 所製備成之本發明化合物之乳化濃縮劑之經稀釋乳液進行葉面施藥(foliar application), 其中, 該經稀釋乳液係藉由以水將該濃縮劑稀釋成特定體積而產生者。在施用後隔天, 將該幼苗藉由噴灑培養於 PSA 培養基所得之蘋果樹斑點病的致病真菌(causal fungus)(蘋果黑星病菌(Venturia inaequalis))的孢子懸浮液而接種, 並於潮溼條件下保持在 20°C。

接種後十四日, 依據式(1)測定防護值(protective value)(%), 並依據下述之判斷標準評估防治效果。

$$\text{防護值(\%)} = \frac{(\text{於未經處理區域中之病斑面積比例}) - (\text{於經處理區域中之病斑面積比例})}{(\text{於未經處理區域中之病斑面積比例})} \times 100 \quad (1)$$

[判斷標準]

- 0：防護值小於 9%
- 1：防護值為 10 至 19%
- 2：防護值為 20 至 29%
- 3：防護值為 30 至 39%
- 4：防護值為 40 至 49%
- 5：防護值為 50 至 59%
- 6：防護值為 60 至 69%
- 7：防護值為 70 至 79%
- 8：防護值為 80 至 89%
- 9：防護值為 90 至 99%
- 10：防護值為 100%

由上述試驗可知，本發明之化合物在活性成分濃度為 50ppm 且施用之乳液量為 50 毫升時展現出優異的防治效果，而尤其是第 1-16、1-17、1-20、1-21、1-22、1-23、1-28、1-29、1-30、1-34、1-37、1-51、1-65、2-1、2-53、2-58、3-4、3-5、3-6、3-7、3-8、3-10、3-11、3-23、3-30、3-37、3-43、3-43-S、3-50、3-51、3-53、3-54、3-58、3-59、3-60、3-61、3-62、3-64、3-65、3-67、3-75、3-76、3-77、3-82、3-86、3-92、3-94、3-96、3-100、3-102、3-103、3-106、3'-5、3'-6、3'-7、3'-11、3'-30、3'-44、3'-61、3'-62、3"-5、3"-8、4-1、5-4、5-5、5-7、5-15、5-20、5-21、5-26、6-1、6-2、6-3、6-5、6-9、6-22、6-24、6-26、9-1 以及 9-2 號之化合物展現出判斷標準為 10 之高活性。比較化合物 A 即使以

高達 200ppm 之 4 倍濃度處理，正如其判斷標準為 0 所證明，其顯示為無效果者。

[試驗例 2]對抗黃瓜植物灰黴病的防治效果之試驗

將種植於直徑 9 公分花盆裡而長成幼苗的一葉齡 (one-leaf aged) 黃瓜植株(栽培品種：Suyou)用依照配方例 1 所製備成之本發明化合物之乳化濃縮劑之經稀釋乳液進行葉面施藥，其中，該經稀釋乳液係藉由以水將該濃縮劑稀釋成特定體積而產生者。

在施用後隔天，將黃瓜植株的子葉，藉由放置已浸泡培養於 PSA 培養基所得之黃瓜植物灰黴病的致病真菌(灰黴菌(*Botrytis cinerea*))的孢子懸浮液之直徑 6 毫米紙片而接種，並於潮溼條件下保持在 20°C。

接種後七日，依據式(2)測定防護值(%), 並依據如試驗例 1 中所述的判斷標準評估防治效果。

$$\text{防護值(\%)} = \frac{(\text{未經處理區域中之病斑直徑}) - (\text{經處理區域中之病斑直徑})}{(\text{未經處理區域中之病斑直徑})} \times 100 \quad (2)$$

由於上述試驗可知，本發明之化合物在活性成分濃度為 50ppm 且施用之乳液量為 50 毫升時展現出優異的防治效果，而尤其是第 1-20、2-1、2-20、2-25、3-4、3-5、3-6、3-7、3-8、3-9、3-10、3-11、3-25、3-30、3-42、3-43、3-43-S、3-51、3-53、3-61、3-62、3-64、3-75、3-77、3-86、3-89、3-92、3-93、3-94、3-96、3-100、3-102、3-103、3-104、3-105、3-106、3'-5、3'-6、3'-7、3'-11、3'-30、3'-42、3'-43、3'-44、3''-5、3''-8、3''-42、4-2、5-21、6-1、6-3、6-19、

6-22、7-1 以及 9-2 號之化合物展現出判斷標準為 10 之高活性。比較化合物 A、比較化合物 B 以及比較化合物 D，正如其判斷標準為 0 所證明，其顯示皆為無效果者。比較化合物 A 即使以高達 200ppm 之 4 倍濃度處理，正如其判斷標準為 0 所證明，其顯示為無效果者。

[試驗例 3]對抗大麥植物白粉病(powdery mildew)的防治效果之試驗

將種植於直徑 6 公分花盆裡而長成幼苗的一葉齡大麥植物(栽培品種：Kantoh 第 6 號)用依照配方例 1 所製備成之本發明化合物之乳化濃縮劑之經稀釋乳液進行葉面施藥，其中，該經稀釋乳液係藉由以水將該濃縮劑稀釋成特定體積而產生者。在施用後隔天，藉由噴灑得自遭受大麥白粉病的致病真菌(布氏大麥白粉菌(*Blumeria graminis* f. sp. hordei))所感染之大麥植株葉子之孢子對大麥植株接種，並使其保持在溫室的條件中。接種後七日，依據如試驗例 1 中所述的判斷標準評估防治效果。

由上述試驗可知，本發明之化合物在活性成分濃度為 50ppm 且施用之乳液量為 50 毫升時展現出優異的防治效果，而尤其是第 1-16、1-25、1-27、1-29、1-30、1-32、1-33、1-34、1-35、1-37、1-39、1-51、1-61、1-63、1-79、2-18、2-25、2-26、2-58、3-4、3-5、3-7、3-9、3-10、3-11、3-25、3-37、3-42、3-43、3-43-S、3-44、3-50、3-51、3-53、3-58、3-60、3-61、3-62、3-64、3-75、3-77、3-86、3-92、3-93、3-94、3-96、3-100、3-102、3-103、3-104、3'-5、3'-7、3'-11、

3'-42、3'-43、3'-45、3'-61、3'-65、3''-42、5-4、5-6、5-7、5-15、5-20、5-21、5-23、6-1、6-4、6-11、6-12、6-13、6-14、6-15、6-18、6-20、6-22、6-23、6-26 以及 9-1 號之化合物展現出判斷標準為 10 之高活性。比較化合物 A、比較化合物 B、比較化合物 C 以及比較化合物 D，正如其判斷標準為 0 所證明，其顯示皆為無效果者。

[試驗例 4] 對抗南方根瘤類線蟲 (南方根瘤線蟲 (*Meloidogyne incognita*)) 的防治效果之試驗

將藉由稀釋本發明化合物之乳化濃縮劑至 500ppm 所製成之乳液澆灌至由甜瓜種子長成之盆栽 (pot-cultivated) 幼苗植物之植物根部，該乳化濃縮劑係依據配方例 1 所製成。澆灌後一日，將南方根瘤類線蟲之水性懸浮液 (大約 500 隻線蟲/毫升) 接種 (土壤灌溉) 至經處理區域及未經處理區域，並將盆栽放置在 25°C 的溫室內。接種後 8 日，用水清洗根部，計算根瘤之數目，並依照下列判斷標準評估其效果。

[判斷標準]

A：無根瘤。

B：出現比未經處理區域明顯更少量之根瘤。

C：出現與未經處理區域等量之根瘤或出現比未經處理區域更多量之根瘤。

由上述試驗可知，藉由植物根部的澆灌處理，本發明之化合物在活性成分濃度為 500ppm 時展現出優異的防治效果，而第 1-16、1-34、3'-43、3'-44 以及 3''-48 號的化合

物依照上述判斷標準，顯示出不低於B的高活性。

[產業利用性]

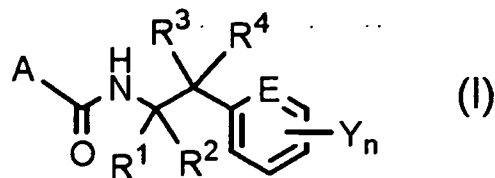
本發明之化合物係有用於作為蟲害防治劑，該蟲害防治劑顯現出對地質環境具低衝擊性、低劑量下具寬廣防治範圍以及優異的防治效力。

本申請案係基於申請於日本之第 077752/2006 號與第 294810/2006 號專利申請案，該等申請案之內容係合併於本文中作參考。

雖然本發明已參照其較佳具體實施例予以表示及說明，但習於此技藝者咸瞭解，在不悖離所附專利範圍所涵蓋之本發明範疇下，可進行各種形式及細節之改變。所有本文中所指出或引用之專利、專利公開案或其他刊物皆以其全文合併於本文中作參考。

十、申請專利範圍：

1. 一種式(I)所示之 N-2-芳基乙基甲醯胺化合物或其鹽類，



其中， R^1 和 R^2 各自獨立為

氫原子；或

(C_1 - C_3)烷基，

或

R^1 和 R^2 視需要相互鍵結形成

(C_3 - C_6)環烷，

R^3 和 R^4 各自獨立為

氫原子；

鹵原子；或

(C_1 - C_6)烷基，或

R^3 和 R^4 視需要相互鍵結形成

(C_3 - C_6)環烷，

R^3 和 R^4 視需要組合形成氧原子，

每個 Y 各自獨立為

鹵原子；

氰基；

羥基；

視需要經鹵原子取代之(C_1 - C_6)烷基；

視需要經鹵原子取代之(C_2 - C_6)烯基；

視需要經鹵原子取代之(C₂-C₆)炔基；

視需要經選自由鹵原子和(C₁-C₆)烷氧基所組成之群組之取代基取代之(C₁-C₆)烷氧基；

視需要經鹵原子取代之(C₂-C₆)烯氧基；

視需要經鹵原子取代之(C₂-C₆)炔氧基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷硫基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基亞砷基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基砷基；

(C₁-C₆)烷氧基-羰基；

視需要經一個或多個取代基取代之苯基，該等取代基係選自取代基群組 Z；

視需要經一個或多個取代基取代之苯氧基，該等取代基係選自取代基群組 Z；或

視需要經一個或多個取代基取代之具有 1 至 3 個相同或不同之選自氧原子、硫原子和氮原子之雜原子之 5 員或 6 員雜環基氧基，該等取代基係選自取代基群組 Z，

n 為 1 至 4 的整數，

當 n 為 2 至 4 的整數時，則相鄰的兩個 Y 視需要彼此鍵結以形成

(C₃-C₅)伸烷基；

(C₃-C₅)伸烯基；

(C₂-C₄)伸烷基氧基；或

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₃)伸烷基二氧基，

取代基群組 Z 為

氫原子；

鹵原子；

氰基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基；

視需要經鹵原子取代之(C₂-C₆)烯基；

視需要經鹵原子取代之(C₂-C₆)炔基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷氧基；

視需要經鹵原子取代之(C₂-C₆)烯氧基；

視需要經鹵原子取代之(C₂-C₆)炔氧基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷硫基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基亞砷基；

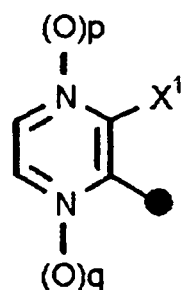
視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基砷基；

(C₁-C₆)烷氧基-羰基；

(C₁-C₆)烷氧基亞胺(C₁-C₃)烷基；或

胺甲醯基，

A 係式(A3)所示之經取代環狀基：



(A3)

其中，X¹ 為

鹵原子；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₃)烷基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₃)烷氧基；

或

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₃)烷硫基，

p 和 q 各自獨立為 0 或 1，以及

E 為

C-H；或

C-Y(Y 係如上所定義者)。

2. 如申請專利範圍第 1 項之 N-2-芳基乙基甲醯胺化合物

或其鹽類，其中，

E 為

C-H；或

C-Y(Y 係如下所定義者)

R¹ 和 R² 各自獨立為

氫原子；或

(C₁-C₃)烷基，或

R¹ 和 R² 視需要相互鍵結形成

(C₃-C₆)環烷，

R³ 和 R⁴ 各自獨立為

氫原子；

鹵原子；或

(C₁-C₆)烷基，

R³ 和 R⁴ 視需要相互鍵結形成

(C₃-C₆)環烷，或

R³ 和 R⁴ 視需要組合形成氧原子，

每個 Y 各自獨立為

鹵原子；

氰基；

羥基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷氧基；

視需要經鹵原子取代之(C₂-C₆)烯氧基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷硫基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基亞砷基；

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基砷基；

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯基，該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基以及

(iii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷氧基；

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之苯氧基，該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基以及

(iii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷氧基；或

視需要經一個或多個相同或不同之取代基取代之具有 1 至 3 個相同或不同之選自氧原子、硫原子和氮原子之雜原子之 5 員或 6 員雜環基氧基，該等取代基係選自下列所組成之群組者：

(i) 鹵原子，

(ii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷基以及

(iii) 視需要經鹵原子取代之(C₁-C₆)烷氧基，

n 為 1 至 3 的整數，

當 n 為 2 或 3 的整數時，則相鄰的兩個 Y 視需要彼此鍵結以形成

(C₃-C₅)伸烷基；

(C₃-C₅)伸烯基；

(C₂-C₄)伸烷基氧基；或

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₃)伸烷基二氧基，

X¹ 為

鹵原子；或

視需要經鹵原子取代之(C₁-C₃)烷基，以及

p 和 q 各為 0。

3. 一種蟲害防治劑，含有如申請專利範圍第 1 項或第 2 項之 N-2-芳基乙基甲醯胺化合物或其鹽類作為活性成分。
4. 如申請專利範圍第 3 項之蟲害防治劑，該蟲害防治劑為植物疾病防治劑。
5. 如申請專利範圍第 3 項之蟲害防治劑，該蟲害防治劑為殺線蟲劑。
6. 一種蟲害防治方法，包括以有效量之如申請專利範圍第 1 項或第 2 項之 N-2-芳基乙基甲醯胺化合物或其鹽類處理目標作物植物或用於栽培該植物之土壤。