



(19) 中華民國智慧財產局

(12) 發明說明書公開本

(11) 公開編號：TW 201609660 A

(43) 公開日：中華民國 105 (2016) 年 03 月 16 日

(21) 申請案號：103139156

(22) 申請日：中華民國 103 (2014) 年 11 月 12 日

(51) Int. Cl. :

C07D231/12 (2006.01)

C07D231/14 (2006.01)

C07D231/16 (2006.01)

C07D231/18 (2006.01)

A01N43/56 (2006.01)

A01P7/04 (2006.01)

(30) 優先權：2013/11/14 歐洲專利局

13192878.0

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

AKTIENGESELLSCHAFT (DE)

德國

(72) 發明人：威爾登 羅伯特 VELTEN, ROBERT (DE)；伯恩克 尼爾斯 BOEHNKE, NIELS

(DE)；溫納 史蒂芬 WERNER, STEFAN (DE)；霍斯特曼 賽巴斯欽

HORSTMANN, SEBASTIAN (DE)；貝克 安琪拉 BECKER, ANGELA (DE)；伊

格 克斯汀 ILG, KERSTIN (DE)；波茲 丹尼耶拉 PORTZ, DANIELA (DE)；沃

斯特 亞恩德 VOERSTE, ARND (DE)；高根斯 烏利奇 GOERGENS, ULRICH

(DE)；特伯格 安卓斯 TURBERG, ANDREAS (DE)

(74) 代理人：林秋琴；陳彥希

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：14 項 圖式數：1 共 74 頁

(54) 名稱

新穎殺蟲劑

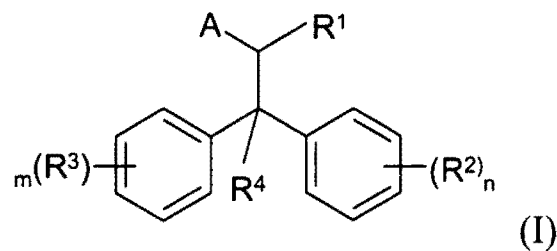
NEW PESTICIDES

(57) 摘要

本申請案係有關一種新穎之殺昆蟲化合物、其製法、其於控制動物害蟲(包括節肢動物，特定言之昆蟲)上之用途。

The present application relates to novel insecticidal compounds, to processes for their preparation, to their use for controlling animal pests including arthropods and in particular insects.

特徵化學式：



201609660

發明摘要

※ 申請案號：103139156

※ 申請日：103.11.12

※IPC 分類：

C07D231/12 (2006.01)

C07D231/14 (2006.01)

C07D231/16 (2006.01)

C07D231/18 (2006.01)

A01N43/56 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

【發明名稱】(中文/英文)

新穎殺蟲劑

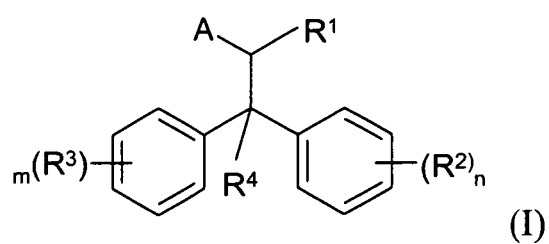
NEW PESTICIDES

【中文】

本申請案係有關一種新穎之殺昆蟲化合物、其製法、其於控制動物害蟲(包括節肢動物，特定言之昆蟲)上之用途。

【英文】

The present application relates to novel insecticidal compounds, to processes for their preparation, to their use for controlling animal pests including arthropods and in particular insects.

【代表圖】**【本案指定代表圖】**： 無**【本代表圖之符號簡單說明】**： 無**【本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式】**：

發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動)

【發明名稱】(中文/英文)

新穎殺蟲劑

NEW PESTICIDES

【技術領域】

【0001】 本發明說明新穎之殺蟲劑、其生產與製造方法、及其作為活性成份(尤其作為殺昆蟲劑與殺寄生蟲劑)之用途。

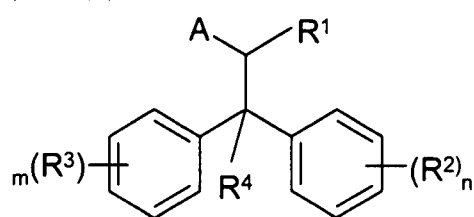
【先前技術】

【0002】 EP 0 158 448 A2、EP 1 940 64 A2 與 WO 1986/002072A1 曾說明 2-唑基-1,1 二苯基丙烷-1-醇作為殺蟲劑。

【0003】 已發現在 1*H*-吡唑-1-基之 4-位置經取代之新穎之經取代之 2-(1*H*-吡唑-1-基)-1,1-二苯基乙烷具有優異之殺昆蟲、殺蜚蟊與/或殺寄生蟲活性。

【發明內容】

【0004】 本發明提供新穎之殺昆蟲性、殺蜚蟊性與/或殺寄生蟲性活性式(I)化合物



其中

A 代表(C₁-C₄)烷基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)鹵烷基或(C₃-C₆)鹵環烷基，較佳為甲基；

R¹代表單-或二取代之 1-吡唑基(= *N*-吡唑基)，其中至少一個取代基位於 1-吡唑基之 4-位置，且其中一個取代基係分別獨立選自下列各物所組成之群中：鹵基、氰基、(C₁-C₄)烷基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷氧基、

(C₁-C₄)鹵烷基、(C₃-C₆)鹵環烷基、或(C₁-C₄)鹵烷氧基。

n 代表 0、1、2、3、4 或 5；較佳為 1、2 或 3；

R²分別獨立代表鹵基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷氧基、(C₁-C₄)硫烷基、(C₁-C₄)鹵硫烷基、(C₃-C₆)環烷基、(C₃-C₆)鹵環烷基、氰基、硝基、-CO(O)-(C₁-C₄)烷基、-(C₁-C₄)烷基-C(O)O-(C₁-C₄)烷基、-(C₁-C₄)鹵烷基-C(O)O-(C₁-C₄)鹵烷基、或-(C₁-C₄)鹵烷基-C(O)O-(C₁-C₄)鹵烷基；或

在基本結構之苯基環上相鄰環位置之兩個 R²可與該兩個相鄰環位置共同形成可視需要經鹵基取代之 5 或 6-員碳環系或雜環系；

m 代表 0、1、2、3、4 或 5；較佳為 0、1、2 或 3，更佳為 1 或 2；

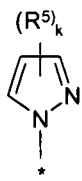
R³ 分別獨立代表鹵基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷氧基、(C₁-C₄)硫烷基、(C₁-C₄)鹵硫烷基、(C₃-C₆)環烷基、(C₃-C₆)鹵環烷基、氰基、硝基、-CO(O)-(C₁-C₄)烷基、-(C₁-C₄)鹵烷基-C(O)O-(C₁-C₄)鹵烷基、-(C₁-C₄)鹵烷基-C(O)O-(C₁-C₄)鹵烷基、或-(C₁-C₄)鹵烷基-C(O)O-(C₁-C₄)鹵烷基；或在基本結構之苯基環上相鄰環位置之兩個 R³可與該兩個相鄰環位置共同形成可視需要經鹵基取代之 5 或 6-員碳環系或雜環系；

R⁴代表氫、羥基、鹵基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷氧基、O-(C₂-C₅)醯基、或 O-(C₂-C₅)鹵醯基；

及式(I)化合物之鹽類、N-氧化物與互變異構型。

【0005】 一項較佳具體實施例中，該式(I)化合物之特徵在於 A 代表(C₁-C₂)烷基，較佳為甲基。

【0006】 一項較佳具體實施例中，該式(I)化合物之特徵在於



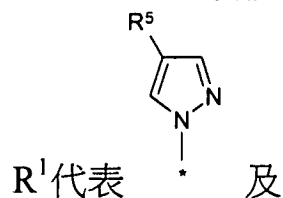
R¹代表

k 代表 1 或 2，及

R⁵代表氰基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷氧基或鹵基，較佳為氟、氯或氰基，更佳係氟或氰基，

但其限制條件為至少一個取代基 R⁵位於 1-吡唑基之 4-位置。

【0007】 一項較佳具體實施例中，該式(I)化合物之特徵在於

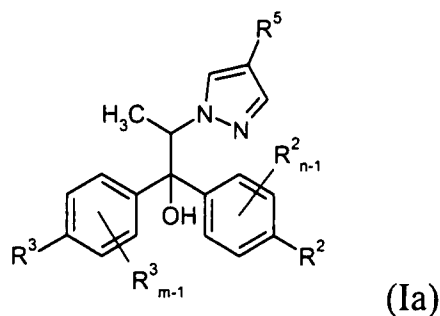


R⁵代表氰基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷氧基或鹵基，較佳為氟、氯或氰基，更佳係氟或氰基。

【0008】 一項較佳具體實施例中，該式(I)化合物之特徵在於 R² 代表甲基、(C₁-C₃)鹵烷基、(C₁)鹵烷氧基、(C₁)鹵硫烷基、氟或氯；或在基本結構之苯基環上相鄰環位置之兩個 R² 與該兩個相鄰環位置共同形成可視需要經鹵基取代(較佳為經氟取代)之 5-員雜環，其包含兩個選自下列各物所組成之群中之雜原子：N 或 O，較佳為 O。

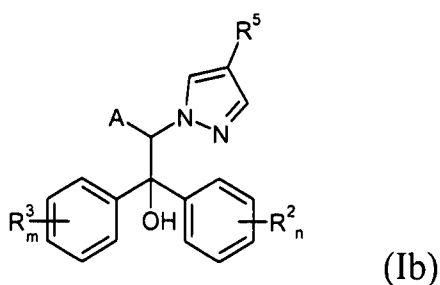
【0009】 一項較佳具體實施例中，該式(I)化合物之特徵在於 R³ 代表甲基、鹵甲基、(C₁)鹵烷氧基或鹵基，如：氟或氯。

【0010】 一項較佳具體實施例中，該式(I)化合物之特徵在於式(I)化合物為式(Ia)化合物



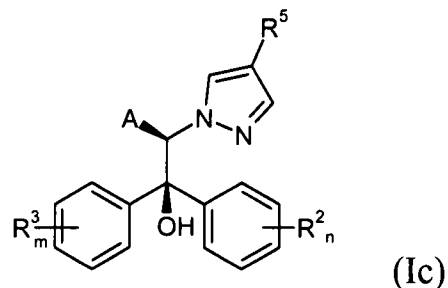
其中 R²、R³、R⁵ 係如本文中之定義，且 n 為 1、2、或 3，及 m 為 1、2 或 3，較佳為其中 R⁵ 為氰基、氯或氟，更佳為氰基或氟。

【0011】 一項較佳具體實施例中，該式(I)化合物之特徵在於式(I)化合物為式(Ib)化合物



其中 R^2 、 R^3 、 R^5 、 n 、與 m 係如本文中之定義，較佳為其中 R^5 為氰基、氯或氟，更佳為氰基或氟；及 A 代表 (C_1-C_4) 烷基。

【0012】 一項較佳具體實施例中，該式(I)化合物之特徵在於式(I)化合物為式(1c)化合物或式(1c)化合物之對映異構物或兩種對映異構物之混合物，



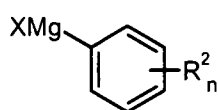
其中 A 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 n 、與 m 係如本文中之定義，較佳係其中 R^5 為氰基、氯或氟，及 A 為甲基。

【0013】 本發明另一態樣係指一種組成物，其特徵在於其包含至少一種本文說明之式(I)化合物與習知之補充劑與/或界面活性劑。

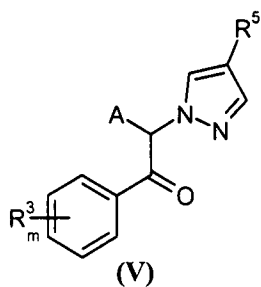
【0014】 本發明另一態樣係指一種控制有害昆蟲之方法，其特徵在於由本文說明之式(I)化合物或本文說明之組成物作用在害蟲與/或其棲息地上。

【0015】 本發明另一態樣係指一種以本文說明之式(I)化合物或本文說明之組成物 於控制昆蟲上之用途。

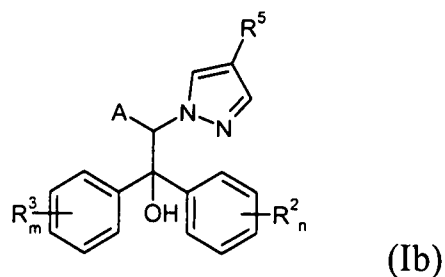
【0016】 本發明另一態樣係指一種製造本文說明之化合物(Ic)之方法，其特徵在於由如下式化合物



與式(V)化合物反應

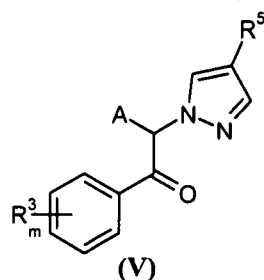


產生式(Ib)化合物



其中 R^2 、 R^3 、 R^5 、 n 、與 m 係如本文中之定義，較佳為其中 R^5 為氰基、氯或氟，更佳為氰基或氟；及 A 代表 (C_1-C_4) 烷基。

【0017】 本發明另一態樣係指一種根據式(V)化合物



其中 R^3 、 R^5 與 m 係如本文中之定義。

定義

【0018】 習此相關技藝之人士咸了解，用於本申請案之術語「一個」或「一種」可能依狀況而定，意指「一個(種)」、「一或更多個(種)」或「至少一個(種)」。

【0019】 異構物：式(I)化合物依取代基之性質而定，可能呈幾何與/或光學活性異構物型式或依不同組成之相應異構物混合物。此等立體異構物為例如：對映異構物、非對映異構物、阻轉異構物或幾何異構物。因此，本發明涵括純的立體異構物與等異構物之任何混合物。

【0020】 鹵素：除非另有其他定義，否則為：第 7 族元素，較佳為氟、氯、溴與碘，更佳為氟、氯與溴，及甚至更佳為氟與氯。鹵基：鹵素基團，例如：氟、氯、溴、碘。

【0021】 烷基，除非另有其他定義，否則為：較佳具有 (C_1-C_4) -、 (C_1-C_3) - 或 (C_1-C_2) - 碳原子之飽和直鏈或分支鏈烴。實例：甲基 [= (C_1) 烷基]、乙基 [= (C_2) 烷基]、丙基 [= (C_3) 烷基]、1-甲基乙基 [= (C_3) 烷基]、丁基 [= (C_4) 烷基]，等等。

【0022】 環烷基，除非另有定義，否則為：較佳具有 (C_3-C_6) -、或 (C_3) - 碳原子之環狀氫烷基。實例：環丙基、環戊基、環丁基、環己基。如本文定義之

環烷基可包含連接環狀烷基與基本結構之 $-\text{CH}_2-$ 連接基(其可視需要經一或兩個鹵基取代)。實例：甲基環丙基[=甲基-(C_3)環烷基]。

【0023】 烷氧基(烷基-O-)，除非另有其他定義，否則係：利用氧原子(-O-)附接基本結構之烷基。例如：甲氧基係指(C_1)-烷氧基，亦即 $\text{CH}_3\text{-O-}$ 。烷氧基較佳係($\text{C}_1\text{-C}_4$)、($\text{C}_1\text{-C}_3$)或($\text{C}_1\text{-C}_2$)烷氧基。實例：甲氧基、乙氧基、丙氧基、1-甲基乙氧基，等等。

【0024】 硫烷基，除非另有其他定義，否則係：利用-S附接基本結構之烷基。例如：硫甲基係指(C_1)硫烷基，亦即 $\text{CH}_3\text{-S-}$ 。硫烷基較佳係($\text{C}_1\text{-C}_4$)、($\text{C}_1\text{-C}_3$)或($\text{C}_1\text{-C}_2$)硫烷基。

【0025】 醯基，除非另有其他定義，否則係：利用 $-\text{C}(=\text{O})-$ 基團附接基本結構之 $-\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 基團(甲醯基)或烷基。例如：(C_1)-醯基係指 $\text{CH}_3\text{-C}(=\text{O})-$ ，(C_0)-醯基係指 $-\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 。醯基較佳係甲醯基、($\text{C}_1\text{-C}_4$)、($\text{C}_1\text{-C}_3$)或($\text{C}_1\text{-C}_2$)醯基。實例： $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})-$ 、 $\text{C}_2\text{H}_5\text{C}(=\text{O})-$ 。

【0026】 雜原子：例如：N、O、S、P、B、Si。

【0027】 碳環系，除非另有其他定義，否則係：可視需要經鹵基取代之單環狀5或6-員碳環系，其中兩個位置(較佳為兩個相鄰位置)亦為苯基部份體之一部份。因此，該環系係由連接這兩個位置(較佳為兩個相鄰位置，其亦為式(I)化合物或其衍生之任何子結構或其製法之中間物之苯基部份基團之一部份)之烷基-或烯基橋連(例如： $-(\text{CH}_2)_z-$ ，其中z代表1至4)組成。此等環系亦可形成芳香系。例如：碳環系與苯基部份基團共同形成茛滿基部份基團或茛基部份基團或二氫萘基部份基團或萘基部份基團。根據本發明碳環系可經至少一個鹵素、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -鹵烷基取代(例如：鹵化碳環系，亦即至少一個C-H被一個C-鹵基置換)。

【0028】 雜環系，除非另有其他定義，否則係：可視需要經鹵基取代之5或6-員雜環基系或雜芳基系，其中兩個位置(較佳為兩個相鄰位置)亦為苯基部份基團之一部份。換言之，雜環系包含至少2個碳原子(其亦為式(I)化合物或其衍生之子結構或其製法中之中間物之苯基部份基團之一部份)與至少一個較佳係選自N、S與O所組成之群中之雜原子與可視需要選用碳原子之橋連基(例如： $-\text{CH}_2\text{-O-CH}_2-$ 或 $-\text{N}=\text{CH-NH-}$)。此等環系亦可形成芳香系。雜環系可

經至少一個鹵素、 C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_2 -鹵烷基取代(例如：鹵化雜環系，亦即至少一個 C-H 被一個 C-鹵基置換)。

【0029】 雜環基系，除非另有其他定義，否則係：碳原子與 1、2 或 3 個較佳係選自 N、O 與 S 所組成之群中之雜原子之可視需要經鹵基取代之單環狀、非芳香系 5 或 6-員環系。

【0030】 雜芳基系，除非另有其他定義，否則係：碳原子與至少一個較佳係選自 N、O 與 S 所組成之群中之雜原子之可視需要經鹵基取代之芳香系單環狀 5-或 6-員雜環系。實例：呋喃、噻吩、吡咯、嘔唑，異嘔唑、噻唑、1,2,3-嘔二唑、吡啶、哌喃、嘔吡、噻吡、硫吡、嗒吡。

【0031】 鹵烷基、鹵環烷基、鹵硫烷基、鹵烷氧基、或鹵醯基，除非另有其他定義，否則係：烷基、環烷基、硫烷基、烷氧基或醯基中至少一個 C-H 被 C-鹵基置換。一項具體實施例中，其中一個該基團之所有 C-H 均被 C-鹵基置換(全鹵化)。實例：氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟乙基、二氟乙基、三氟乙基、五氟乙基、氟甲氧基、氟硫甲基，等等。

【0032】 下文說明本申請案之具體實施例。習此相關技藝之人士咸了解可以組合此等具體實施例。其中不包括違反天然法則之組合，因此習此相關技藝之人士即可依據其專業知識排除此等組合。

【圖式簡單說明】

無

【實施方式】

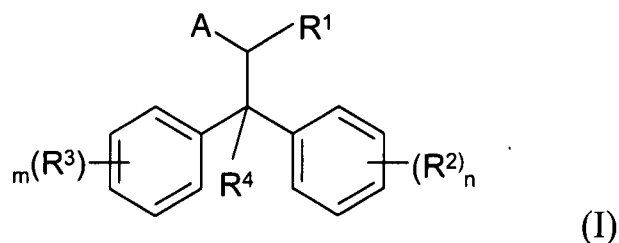
【0033】 習此相關技藝之人士咸了解，所有具體實施例均可單獨或組合呈現。

【0034】 依據取代基之性質，式(I)、式(II)與式(A)化合物若適當時可呈鹽型、互變異構物、幾何與/或光學活性異構物或相應異構物依不同組成之混合物。

【0035】 若適當時，根據本發明化合物可呈各種不同多晶型或各種不同多晶型之混合物。本發明提供純的多晶型與多晶型混合物，且均可依據本發明使用。

【0036】 下文更詳細說明式(I)化合物之具體實施例：

【0037】 式(I)化合物



其中

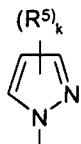
- A 代表(C₁-C₄)烷基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)鹵烷基或(C₃-C₆)鹵環烷基；
- R¹ 代表單-或二取代之 1-吡啶基，其中至少一個取代基位於 1-吡啶基之 4-位置，且其中一個取代基係分別獨立選自下列各物所組成之群中：鹵基、氰基、(C₁-C₄)烷基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₃-C₆)鹵環烷基、或(C₁-C₄)鹵烷氧基；
- n 代表 0、1、2、3、4 或 5；較佳為 1、2 或 3；
- R² 分別獨立代表鹵基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷氧基、(C₁-C₄)硫烷基、(C₁-C₄)鹵硫烷基、(C₃-C₆)環烷基、(C₃-C₆)鹵環烷基、氰基、硝基、-CO(O)-(C₁-C₄)烷基、-(C₁-C₄)烷基-C(O)O-(C₁-C₄)烷基、-(C₁-C₄)烷基-C(O)O-(C₁-C₄)鹵烷基、-(C₁-C₄)鹵烷基-C(O)O-(C₁-C₄)鹵烷基、或-(C₁-C₄)鹵烷基-C(O)O-(C₁-C₄)鹵烷基；或
基本結構之苯基環上相鄰環位置之兩個 R² 可與該兩個相鄰環位置共同形成可視需要經鹵基取代之 5 或 6-員碳環系或雜環系；
- m 代表 0、1、2、3、4 或 5；較佳為 0、1、2 或 3，更佳為 1 或 2；
- R³ 分別獨立代表鹵基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷氧基、(C₁-C₄)硫烷基、(C₁-C₄)鹵硫烷基、(C₃-C₆)環烷基、(C₃-C₆)鹵環烷基、氰基、硝基、-CO(O)-(C₁-C₄)烷基、-(C₁-C₄)烷基-C(O)O-(C₁-C₄)鹵烷基、-(C₁-C₄)鹵烷基-C(O)O-(C₁-C₄)鹵烷基、或-(C₁-C₄)鹵烷基-C(O)O-(C₁-C₄)鹵烷基；或
基本結構之苯基環上相鄰環位置之兩個 R³ 可與該兩個相鄰環位置共同形成可視需要經鹵基取代之 5 或 6-員碳環系或雜環系；
- R⁴ 代表羥基、鹵基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷氧基、(C₁-C₄)硫烷基、(C₁-C₄)鹵硫烷基、O-(C₂-C₅)醯基、或 O-(C₂-C₅)

鹵醯基；

及式(I)化合物之鹽類、N-氧化物與互變異構型。

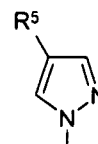
【0038】 一項較佳具體實施例係指式(I)化合物，其中 A 代表(C₁-C₄)烷基，更佳為(C₁-C₂)烷基，甚至更佳係甲基。

【0039】 另一項較佳具體實施例係指式(I)化合物，其中



R¹代表 · ，及

其中 k 代表 1 或 2，及 R⁵ 彼此分別獨立代表氰基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷氧基或鹵基，但其限制條件為至少一個取代基 R⁵ 位於 1-吡唑基之 4-位置。更佳為 R⁵ 彼此分別獨立代表氰基、甲基、鹵甲基(如：三氟甲基或三氯甲基)、甲氧基、鹵甲氧基(如：三氟甲氧基或三氯甲氧基)、氟或氯，但其限制條件為至少一個取代基 R⁵ 位於 1-吡唑基之 4-位置。最佳為在 1-吡唑基 4-位置之 R⁵ 為氟或氰基。



【0040】 一項更佳具體實施例係指式(I)化合物，其中 R¹代表 · ，及 R⁵ 代表(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)烷氧基、氰基、或鹵基，較佳為(C₁-C₂)烷基、(C₁-C₂)烷氧基、氰基、或鹵基，更佳係甲基、甲氧基、氰基或鹵基，如：氟、氯或溴，甚至更佳係氰基或氟，最佳係氟。

【0041】 一項更佳具體實施例係指式(I)化合物，其中 R⁵ 代表氟。

【0042】 另一項較佳具體實施例係指式(I)化合物，其中 R⁴ 代表-OH、-O-(C₁-C₄)醯基或-O-(C₁-C₄)鹵醯基，較佳為-OH。

【0043】 又另一項較佳具體實施例係指式(I)化合物，其中 n 代表 0、1、2、或 3，較佳為 1、2 或 3。

【0044】 又另一項較佳具體實施例係指式(I)化合物，其中 n 代表 1、2、或 3，及至少一個 R² 位於基本結構之苯基部份基團 4-位置(對位)。

【0045】 另一項較佳具體實施例係指式(I)化合物，其中 R² 彼此分別獨立代表(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷氧基、(C₁-C₄)硫

烷基、(C₁-C₄)鹵硫烷基、(C₁-C₄)鹵烷基-苯基(例如：-CF₂-Ph)、或鹵基；或在基本結構之苯基環上相鄰環位置之兩個 R² 與該兩個相鄰環位置共同形成可視需要經鹵基取代之 5-員雜環，其包含一或兩個選自下列各物所組成之群中之雜原子：N、O 或 S。更佳為 R² 代表(C₁-C₂)烷基、(C₁-C₃)鹵烷基、(C₁-C₃)鹵烷氧基、(C₁-C₃)鹵硫烷基 (C₁-C₂)鹵烷基-苯基、氟、氯、溴、或碘；或在基本結構之苯基環上相鄰環位置之兩個 R² 與該兩個相鄰環位置共同形成可視需要經鹵基取代之 5-員雜環，其包含兩個選自下列各物所組成之群中之雜原子：N、O 或 S。甚至更佳為 R² 代表甲基、(C₁-C₃)鹵烷基(如：(C₁-C₃)氟烷基(例如：三氟甲基、四氟乙基或七氟丙基))、(C₁)鹵烷氧基(如：(C₁)氟烷氧基(例如：二氟甲氧基或三氟甲氧基))、(C₁)鹵硫烷基(如：(C₁)氟硫烷基(例如：三氟硫甲基))、氟或氯，或在基本結構之苯基環上相鄰環位置之兩個 R² 與該兩個相鄰環位置共同形成可視需要經鹵基取代之 5-員雜環，其包含兩個選自下列各物所組成之群中之雜原子：N 或 O，較佳為 O(例如：兩個 R² 代表鍵結在基本結構之苯基環之 4 與 3-位置之-O-CF₂-O-部份基團)。

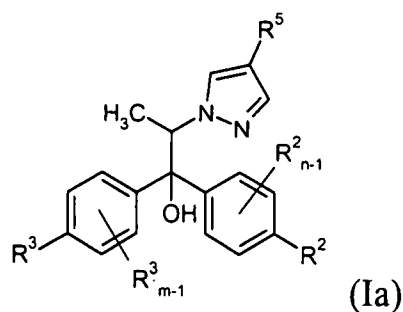
【0046】 又另一項較佳具體實施例係指式(I)化合物，其中 m 代表 1、2、或 3，更佳為 1 或 2，甚至更佳係 1。

【0047】 又另一項較佳具體實施例係指式(I)化合物，其中 m 代表 1、2、或 3，更佳為 1 或 2，甚至更佳係 1，及至少一個 R³ 位於該基本結構之苯基部份基團之 4-位置(對位)。

【0048】 另一項較佳具體實施例係指式(I)化合物，其中 R³ 彼此分別獨立代表(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷氧基、(C₁-C₄)硫烷基、(C₁-C₄)鹵硫烷基、(C₁-C₂)鹵烷基-苯基、或鹵基；或在基本結構之苯基環上相鄰環位置之兩個 R³ 與該兩個相鄰環位置共同形成可視需要經鹵基取代之 5-員雜環，其包含一或兩個選自下列各物所組成之群中之雜原子：N、O 或 S。更佳為 R³ 代表(C₁-C₂)烷基、(C₁-C₃)鹵烷基、(C₁-C₃)鹵烷氧基、氟、氯、溴或碘。甚至更佳為 R³ 代表甲基、鹵甲基(如：氟甲基(例如：三氟甲基))、(C₁)鹵烷氧基(如：(C₁)氟烷氧基(例如：三氟甲氧基))或鹵基(如：氟)。

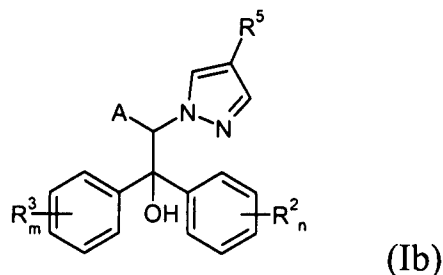
【0049】 一項較佳具體實施例中，鹵化基團(如：鹵代碳環系、鹵代雜環系、鹵烷基、鹵環烷基、鹵烷氧基與鹵硫烷基)為全鹵化，較佳為全氟化。

【0050】 另一項較佳具體實施例係指式(Ia)化合物



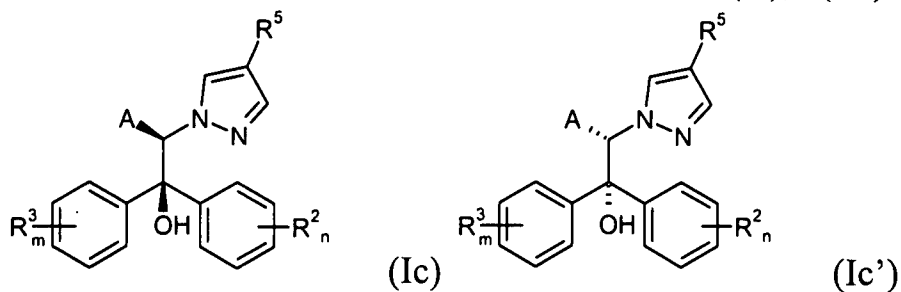
其中 R^2 、 R^3 、 R^5 係如本文中之定義，且 n 為 1、2 或 3，及 m 為 1、2 或 3，較佳為其中 R^5 為氨基或氟。

【0051】 另一項較佳具體實施例係指式(Ib)化合物



其中 R^2 、 R^3 、 R^5 、 n 、與 m 係如本文中之定義，較佳為其中 R^5 為氨基或氟；與 A 代表 (C_1-C_4) 烷基。

【0052】 另一項較佳具體實施例係指包含或組成為式(Ic)與(Ic')之混合物



其中 A 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 n 、與 m 係如本文中之定義，較佳為其中 R^5 為氨基或氟，及 A 為甲基。

方法與用途

【0053】 本發明亦有關控制動物害蟲之方法，其中由式(I)化合物作用在動物害蟲與/或其棲息地上。動物害蟲之控制較佳係用在農業與森林中、及保護原料。較佳係不包括用在人類或動物身體之手術或醫療處理及人類或動物身體之診斷方法。

【0054】 本發明進一步有關以式(I)化合物作為殺蟲劑，特定言之作為作物保護劑之用途。

【0055】 本申請案內容中，各例中之術語「殺蟲劑」亦總是包括術語「作物保護劑」。

【0056】 式(I)化合物具有良好之植物耐受性、對恆溫動物有利之毒性及良好之環境相容性，適合保護植物與植物器官來對抗生物性與非生物性逆境壓力，提高收成產量、改進收成材料品質、及控制動物害蟲，尤指出現在農業、園藝、動物畜養、水產養殖、森林、花園與休閒設施之昆蟲、蜘蛛、蠕蟲、線蟲與軟體動物，可用於保護庫存產品與材料，及用於衛生領域。其較佳係作為殺蟲劑使用。其可活性對抗正常敏感性與抗性物種，及對抗所有或個別發展階段。上述害蟲包括：

節肢動物門(Arthropoda)之害蟲；唇足綱(Chilopoda)；彈尾目(Collembola)或彈尾綱；重足綱(Diplopoda)；昆蟲綱，例如：蜚蠊目(Blattodea)；鞘翅目(Coleoptera)；雙翅目(Diptera)；半翅目(Hemiptera)；異翅亞目(Heteroptera)；膜翅目(Hymenoptera)；等足目(Isopoda)；等翅目(Isoptera)；鱗翅目(Lepidoptera)；直翅目(Orthoptera)或跳躍亞目(Saltatoria)；毛蟲目(Phthiraptera)；嚙蟲目(Psocoptera)；蚤目(Siphonaptera)；纓翅目(Thysanoptera)；總尾目(Zygentoma)(=纓尾亞目(Thysanura))；結合目(Symphyla)；軟體動物門(Mollusca)及腹足綱(Gastropoda)之害蟲；來自扁形動物門(Plathelminthes)與線蟲綱(Nematoda)之動物寄生蟲；來自線蟲綱(Nematoda)之植物害蟲，亦即植物寄生性線蟲。

【0057】 此外，亦可能控制原生動物門(Protozoa)，球蟲目(Coccidia)，例如：艾美球蟲屬(*Eimeria* spp)。

【0058】 式(I)化合物亦可在某些濃度或施用率下，作為除草劑、安全劑、生長調節劑或改善植物性質之製劑，作為殺微生物劑或殺配子劑使用，例如：作為殺真菌劑、抗霉劑、殺細菌劑、殺病毒劑(包括對抗類病毒之製劑)或作為對抗 MLO(似黴漿菌生物體)與 RLO(似立克次體生物體)之製劑。若適當時，其亦可作為合成其他活性化合物之中間物或前體使用。

調配物

【0059】 本發明進一步係有關一種調配物，及由其製成殺蟲劑之施用型式，例如：包含至少一種式(I)化合物之浸藥水、滴藥水及噴灑液。有些例子中，該施用型式可包含其他農藥與/或改善作用之佐劑，如：滲透劑，例如：植物油類(例如：菜籽油、葵花油)、礦物油類(例如：鏈烷烴油類)、植物脂肪酸之烷基酯類(例如：菜籽油甲酯或大豆油甲酯)、或烷醇烷氧化物，與/或擴散劑，例如：烷基矽氧烷與/或鹽類，例如：有機或無機銨或磷鹽，例如：硫酸銨或磷酸氫二銨，與/或促進滯留劑，例如：磺基琥珀酸二辛酯或羥基丙基關華豆膠聚合物與/或保濕劑，例如：甘油與/或肥料，例如：含銨、鉀或磷之肥料。

【0060】 典型之調配物為例如：水溶性液體(SL)、乳化濃縮劑(EC)、水性乳液(EW)、懸浮濃縮劑(SC、SE、FS、OD)、水可勻散性粒劑(WG)、粒劑(GR)及膠囊濃縮劑(CS)；此等及其他可能之調配物型式說明於例如：由 2004 年 FAO/WHO 聯合農藥會議 (FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications)所製作之”FAO 植物生產與保護報告-173(FAO Plant Production and Protection Papers – 173)中之”國際作物生命與農藥說明，FAO 與 WHO 農藥說明之發展及用法手冊(Crop Life International and in Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticide)，ISBN：9251048576。該調配物中除了一種或多種式(I)化合物外，尚可包含其他農化活性化合物。

【0061】 該等調配物或施用型式最好包含輔劑，例如：補充劑、溶劑、自發性促進劑、載劑、乳化劑、勻散劑、防凍劑、殺生物製劑、增稠劑與/或其他輔劑，例如：佐劑。本文中，佐劑為加強調配物生物效應之組成份，該組成份本身不需具有任何生物效應。佐劑實例為促進滯留、擴散、附著在葉表面、或促進滲透之製劑。

【0062】 這類調配物係依已知方式製備，例如：混合式(I)化合物與輔劑，如，例如：補充劑、溶劑及/或固態載劑及/或其他輔劑，如，例如：界面活性劑。調配物係於合適設備中製備或在施用前或施用期間製備。

【0063】 所使用之輔劑可為適合對式(I)化合物之調配物或由此等調配物製成之施用型式(例如：即用型殺蟲劑，如：噴灑液或拌種劑)賦與特殊性質，如：某些物理性質、技術性質與/或生物性質之物質。

【0064】 合適之補充劑為例如：水、極性與非極性有機化學液體，例如：芳香系與非芳香系烴類(如：鏈烷烴、烷基苯、烷基萘、氯苯)、醇類與多元醇(若適當時，亦可經取代、醚化與/或酯化)、酮類(如：丙酮、環己酮)、酯類(包括脂肪類與油類)與(聚)醚類、未取代與經取代之胺類、醯胺類、內醯胺類(如：N-烷基吡咯啉酮)與內酯類、礬類與亞礬類(如：二甲亞礬)。

【0065】 若使用水作為補充劑時，亦可使用例如：有機溶劑作為輔助溶劑。基本上適用之液態溶劑為：芳香族如：二甲苯、甲苯或烷基萘類，氯化芳香烴與氯化脂族烴類如：氯苯、氯化乙烯或二氯甲烷，脂族烴類如：環己烷或鏈烷烴，例如：礦物油分餾物、礦物油與植物油，醇類如：丁醇或甘醇及其醚類與酯類，酮類如：丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁基酮或環己酮，強極性溶劑如：二甲基甲醯胺與二甲亞礬，及水。

【0066】 原則上，可以使用所有合適之溶劑。合適溶劑實例為：芳香烴如：二甲苯、甲苯或烷基萘類，氯化芳香烴或氯化脂族烴類如：氯苯、氯化乙烯或二氯甲烷，脂族烴類如：環己烷、鏈烷烴、石油分餾物、礦物油與植物油，醇類如：甲醇、乙醇、異丙醇、丁醇或甘醇及其醚類與酯類，酮類如：丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁基酮或環己酮，強極性溶劑如：二甲亞礬，及水。

【0067】 原則上，可以使用所有合適之載劑。合適之載劑特別包括：例如：銨鹽及天然礦物磨粉如：高嶺土、黏土、滑石、白堊、石英、矽鎂土、蒙脫土或矽藻土，及合成物質磨粉如：高分散度矽石、礬土與天然或合成矽酸鹽、樹脂、蠟類及/或固體肥料。亦可使用此等載劑之混合物。適用為粒劑之載劑包括例如：粉碎與分碎天然礦石，如：方解石、大理石、浮石、海泡石、白雲石，及無機與有機磨粉之合成顆粒，及有機物質顆粒如：鋸屑、紙、椰子殼、玉米穗與煙草桿。

【0068】 亦可使用液化氣態補充劑或溶劑。尤其合適之補充劑或載劑係彼等在常溫及常壓下呈氣態者，例如：氣霧劑推進氣體，如：鹵烴類，及丁烷、丙烷、氮氣及二氧化碳。

【0069】 具有離子性或非離子性性質之乳化劑與/或發泡劑、勻散劑或濕化劑或此等界面活性劑混合物之實例為：聚丙烯酸之鹽類、木質素磺酸之鹽類、苯酚磺酸或萘磺酸之鹽類、環氧乙烷與脂肪醇或與脂肪酸或與脂肪胺、與經取代之苯酚(較佳為烷基苯酚或芳基苯酚)之聚縮合物、磺基琥珀酸酯之鹽類、牛磺酸衍生物(較佳為牛磺酸烷基酯)、聚乙氧基化醇或苯酚之磷酸酯、多元醇之脂肪酸酯，及含硫酸根、磺酸根與磷酸根之化合物之衍生物，例如：烷基芳基聚二醇醚、烷基磺酸鹽、烷基硫酸鹽、芳基磺酸鹽、蛋白質水解物、木質素亞硫酸鹽廢液及甲基纖維素。若其中一種式(I)化合物與/或其中一種惰性載劑為水不可溶且若該施用方式係在水中進行時，則宜含有界面活性劑。

【0070】 調配物及其所衍生之施用型式中亦可使用著色劑，如：無機色素(例如：氧化鐵，氧化鈦與普魯士藍)及有機染料，如：茜素染料、偶氮染料及金屬酞花青染料，及微量營養素如：鐵、錳、硼、銅、鈷、鉬與鋅之鹽類作為額外輔劑。

【0071】 亦可包括安定劑，如：低溫安定劑、防腐劑、抗氧化劑、光安定劑或其他改善化學/物理安定性之組份。亦可包含泡沫形成劑或消泡劑。

【0072】 調配物及其所衍生之施用型式中亦可使用膠黏劑，如：羧甲基纖維素，及呈粉末、顆粒或膠乳型式之天然與合成聚合物，如：阿拉伯膠、聚乙烯醇與聚乙酸乙烯酯，或天然磷脂如：腦磷脂與卵磷脂，及合成磷脂，作為額外輔劑。其他可能之輔劑為礦物油與植物油。

【0073】 調配物及其所衍生之施用方式中亦可視需要包含其他輔劑。此等可能添加劑包括：香料、保護性膠體、結合劑、黏著劑、增稠劑、搖溶劑、滲透劑、促進滯留劑、安定劑、螯合劑、錯合劑、保濕劑、擴散劑。通常，式(I)化合物可組合使用常用於調配目的之任何固態或液態添加劑。

【0074】 適用之促進滯留劑包括所有彼等可降低動態表面張力之物質，例如：磺基琥珀酸二辛酯，或可提高黏彈性之物質，例如：羥基丙基關華豆膠聚合物。

【0075】 本文中合適之滲透劑為所有彼等常用於改善農化活性化合物滲透進入植物之物質。本文中，滲透劑之定義為其有能力從(通常為水性)施用液體與/或從噴灑覆層開始滲入植物之角質層，藉以提高活性化合物在角質層中之移動性。此性質可採用文獻中曾說明之方法決定(Baur 等人, 1997, Pesticide

Science 51, 131-152)。其實例包括例如：醇烷氧化物，如：椰子脂肪乙氧化物(10)或異十三烷基乙氧化物(12)、脂肪酸酯，例如：菜籽油甲酯或大豆油甲酯、脂肪胺烷氧化物，例如：獸脂胺乙氧化物(15)，或銨與/或磷鹽類，例如：硫酸銨或磷酸氫二銨。

【0076】 該調配物較佳係包含佔調配物重量之 0.00000001 至 98%重量比之式(I)化合物，或特別佳係 0.01%至 95%重量比之式(I)化合物，更佳為 0.5%至 90%重量比之式(I)化合物。

【0077】 由調配物製成之施用形式(特定言之殺蟲劑)中之式(I)化合物含量可在很大範圍內變化。施用形式中式(I)化合物濃度通常可為佔該施用形式重量之 0.00000001 至 95%重量比之式(I)化合物，較佳為 0.00001 至 1%重量比。該等化合物係依適合施用型式之習知方式使用。

混合物

【0078】 式(I)化合物亦可與與一種或多種合適之殺真菌劑、殺細菌劑、殺蟎劑、殺軟體動物劑、殺線蟲劑、殺昆蟲劑、殺微生物劑、有利物質、除草劑、肥料、驅鳥劑、強化植物劑、不孕劑、安全劑、化學信息物質及/或生長調節劑形成混合物使用，藉以例如：擴大作用範圍、延長作用效期、提高作用速率、防止排斥或預防發展出抗性。此外，這種活性化合物組合可以改善植物生長及/或對非生物性逆境壓力之耐受性，例如：對高溫或低溫、對乾旱或對水份及/或鹽份含量上升之耐受性。亦可改善開花與結果性能、優化發芽能力與根部發展、促進收成及改善產量、影響成熟、改善所收成產物之品質與/或營養價值、延長儲存壽命及/或改善所收成產物之可加工性質。

【0079】 此外，式(I)化合物可與其他活性化合物或化學信息物質(如：引誘劑與/或驅鳥劑與/或植物活化劑與/或生長調節劑與/或肥料)形成混合物。同樣地，式(I)化合物可用於改善植物性質，如，例如：生長、產量、與收成材料之品質。

【0080】 根據本發明特定具體實施例中，式(I)化合物係與其他化合物，較佳係與下文說明之化合物形成混合物而含在調配物中或由該調配物製成之施用型式中。

【0081】 若下文述及之其中一種化合物可出現不同互變異構型，即使沒有個別出示，此等型式亦均包括在內。

殺昆蟲劑/殺蟬蟎劑/殺線蟲劑

【0082】 本文中以其俗名稱呼之活性化合物為已知者且說明於例如：農藥手冊(“農藥指南 (The Pesticide Manual)”第 16 版, British Crop Protection Council 2012) 或可參見網際網路 (例如：<http://www.alanwood.net/pesticides>)。

(1)乙醯基膽鹼酯酶(AChE)抑制劑，如，例如：胺甲酸酯類，例如：安利卡(alanycarb)、得滅克(aldicarb)、本得卡(bendiocarb)、本伏卡(benfuracarb)、布卡辛(butocarboxim)、丁氧布卡辛(buthoxycarboxim)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、丁基加保扶(carbosulfan)、抑芬卡(ethiofencarb)、芬布卡(fenobucarb)、覆滅蟎(formetanate)、伏賽卡(furathiocarb)、滅必蝨(isoprocarb)、滅賜克(methiocarb)、納乃得(methomyl)、滅特卡(metolcarb)、歐殺滅(oxamyl)、比加普(pirimicarb)、安丹(propoxur)、硫敵克(thiodicarb)、硫芬斯(thiofanox)、三辛滅(triazamate)、三滅卡(trimethacarb)、XMC 與滅爾蝨(xylylcarb)；或有機磷酸酯類，例如：歐殺松(acephate)、亞滅伏(azamethiphos)、谷速松(azinphos)-乙基、谷速松(azinphos)-甲基、卡速松(cadusafos)、氯乙松(chlorethoxyfos)、氯芬松(chlorfenvinphos)、氯滅松(chlormephos)、陶斯松(chlorpyrifos)、陶斯松(chlorpyrifos)-甲基、庫伏斯(coumaphos)、氰乃松(cyanophos)、滅賜松(demeton)-S-甲基、大利松(diazinon)、二氯松(dichlorvos)/DDVP、雙特松(dicrotophos)、大滅松(dimethoate)、大芬松(dimethylvinphos)、二硫松(disulfoton)、EPN、愛殺松(ethion)、普伏松(ethoprophos)、胺磺磷(famphur)、芬滅松(fenamiphos)、撲滅松(fenitrothion)、芬殺松(fenthion)、福賽特(fosthiazate)、飛達松(heptenophos)、抑滅伏(imicyafos)、抑伏松(isofenphos)、O-(甲氧基胺基硫代磷醯基)水楊酸異丙基酯、抑殺松(isoxathion)、馬拉松(malathion)、滅加松(mecarbam)、達馬松(methamidophos)、滅大松(methidathion)、美文松(mevinphos)、亞素靈(monocrotophos)、乃立松(naled)、歐滅松(omethoate)、歐滅賜松(oxydemeton)-甲基、巴拉松(parathion)、巴拉松(parathion)-甲基、賽達松(phenthoate)、福瑞松(phorate)、裕必松(phosalone)、益滅松(phosmet)、福賜米松(phosphamidon)、辛硫磷(phoxim)、亞特松(pirimiphos)-甲基、佈飛松(profenofos)、普丹松(propetamphos)、普硫松(prothiofos)、必伏松(pyraclufos)、

必芬松(pyridaphenthion)、拜裕松(quinalphos)、速伏特(sulfotep)、特必松(tebupirimfos)、亞培松(temephos)、託福松(terbufos)、四氯松(tetrachlorvinphos)、硫滅松(thiometon)、三落松(triazophos)、三氯松(triclorfon)與繁米松(vamidothion)。

(2)GABA-閘控之氯離子通道攔抗劑，如，例如：環二烯有機氯，例如：克丹(chlordane)與安殺番(endosulfan)；或苯基吡唑類(飛普洛類(Fiprole))，例如：抑普洛(ethiprole)與芬普洛(fipronil)。

(3)鈉通道調節劑/依賴電壓之鈉通道阻斷劑，如，例如：擬除蟲菊酯類，例如：阿納寧(acrinathrin)、丙烯菊酯(allethrin)、d-順式-反式丙烯菊酯(allethrin)、d-反式丙烯菊酯(allethrin)、畢芬寧(bifenthrin)、右亞列寧(bioallethrin)、右亞列寧(bioallethrin)S-環戊烯基異構物、必賽靈(bioresmethrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、β-賽扶寧(cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、λ-賽洛寧(cyhalothrin)、γ-賽洛寧(cyhalothrin)、賽滅寧(cypermethrin)、α-賽滅寧(cypermethrin)、β-賽滅寧(cypermethrin)、θ-賽滅寧(cypermethrin)、ζ-賽滅寧(cypermethrin)、賽芬寧(cyphenothrin)[(1R)-反式異構物]、第滅寧(deltamethrin)、依普靈(empenthrin)[(EZ)-(1R)異構物]、益化利(esfenvalerate)、依芬寧(etofenprox)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、福本賽寧(flucythrinate)、伏滅寧(flumethrin)、τ-福化利(flualinate)、海本斯(halfenprox)、益普靈(imiprothrin)、剋特寧(kadethrin)、百滅寧(permethrin)、芬特寧(phenothrin)[(1R)-反式異構物]、普烈靈(prallethrin)、除蟲菊酯(pyrethrins(pyrethrum))、利滅靈(resmethrin)、希拉芬(silafluofen)、特伏靈(tefluthrin)、特滅靈(tetramethrin)、特滅靈(tetramethrin)[(1R)異構物]、泰滅寧(tralomethrin)與參伏靈(transfluthrin)；或 DDT；或美克氯(methoxychlor)。

(4)菸鹼激導性乙醯基膽鹼受體(nAChR)促效劑，如，例如：類新菸鹼類，例如：乙醯普(acetamiprid)、克利定(clothianidin)、第諾芬(dinotefuran)、益達胺(imidacloprid)、尼普爛(nitenpyram)、硫克比(thiacloprid)與賽速安(thiamethoxam)；或尼古丁或磺蟲啉(sulfoxaflor)。

(5)異位性菸鹼激導性乙醯基膽鹼受體(nAChR)活化劑，如，例如：賜諾殺類(Spinosyns)、例如：賜諾特(spinetoram)與賜諾殺(spinosad)。

(6)氯離子通道活化劑，如，例如：抑滅克定類(ivermectins)/美保黴素

(milbemycin)，例如：艾滅克定(abamectin)、抑滅克定(emamectin)苯甲酸鹽、利滅克定(lepimectin)與美保克定(milbemectin)。

(7)幼保激素擬似物，如，例如：幼保激素類似物，例如：赫普靈(hydroprene)、克普靈(kinoprene)與滅普靈(methoprene)；或吩克卡(fenoxycarb)；或必普芬(pyriproxyfen)。

(8)作用機轉未知或非專一性之活性化合物，如，例如：烷基鹵化物，例如：甲基溴及其他烷基鹵化物；或氯吡靈(chloropicrin)；或硫醯氟；或硼砂；或酒石酸銻鉀鹽。

(9)選擇性抗攝食劑，例如：必滅辛(pymetrozine)或伏卡滅(flonicamid)。

(10)蟎生長抑制劑，例如：克芬辛(clofentezine)、海賽唑(hexythiazox)與地伏辛(diflovidazin)或抑特唑(etoxazole)。

(11)昆蟲腸膜之微生物瓦解劑，例如：蘇雲金芽胞桿菌以色列亞種(*Bacillus thuringiensis* subspecies *israelensis*)、球形芽孢桿菌(*Bacillus sphaericus*)、蘇雲金芽胞桿菌鮎澤亞種(*Bacillus thuringiensis* subspecies *aizawai*)、蘇雲金芽胞桿菌庫斯塔基亞種(*Bacillus thuringiensis* subspecies *kurstaki*)、蘇雲金芽胞桿菌殺蟲亞種(*Bacillus thuringiensis* subspecies *tenebrionis*)與 BT 植物蛋白質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab1。

(12)氧化性磷酸化反應抑制劑，ATP 瓦解劑，如，例如：地芬能(diafenthiuron)；或有機錫化合物，例如：亞賽錫(azocyclotin)、賽赫錫(cyhexatin)與芬塔錫(fenbutatin)氧化物；或歐蟎多(propargite)或特達芬(tetradifon)。

(13)干擾 H⁺ 質子梯度之氧化性磷酸化反應去偶合劑，如，例如：克芬吡(chlorfenapyr)、DNOC 與氟蟲胺(sulfluramid)。

(14)菸鹼激導性乙醯基膽鹼受體拮抗劑，如，例如：本速達(bensultap)、培丹(cartap)鹽酸鹽、硫克蘭(thiocylam)與硫速伏(thiosultap)-鈉。

(15)幾丁質生合成抑制劑，第 0 型，如，例如：必賽伏(bistrifluron)、克伏能(chlofluazuron)、地伏能(diflubenzuron)、福環脲(flucycloxuron)、氟芬隆(flufenoxuron)、赫姆能(hexaflumuron)、利芬能(lufenuron)、利化能(novaluron)、諾化能(noviflumuron)、特速能(teflubenzuron)與三伏能(triflumuron)。

(16)幾丁質生合成抑制劑，第 1 型，如，例如：佈芬辛(buprofezin)。

(17)蛻變瓦解劑(特定言之雙翅目，亦即雙翅目昆蟲)，如，例如：賽麻辛(cyromazine)。

(18)脫皮激素受體促效劑，如，例如：可芬諾(chromafenozide)、赫芬賽(halofenozide)、甲氧芬賽(methoxyfenozide)與特芬賽(tebufenozide)。

(19)章魚胺激導性促效劑，如，例如：三亞蟎(amitraz)。

(20)複合物-III 電子傳遞抑制劑，如，例如：海滅能(hydramethylnone)或亞克希(acequinocyl)或伏克靈(flucrypyrim)。

(21)複合物-I 電子傳遞抑制劑，例如：METI 殺蟎劑，例如：芬殺蟎(fenazaquin)、芬普蟎(fenpyroximate)、普靈芬(pyrimidifen)、畢達本(pyridaben)、達芬必(tebufenpyrad)與特芬必(tolfenpyrad)；或魚藤精(rotenone)(Derris)。

(22)電壓閘控之鈉通道阻斷劑，例如：因得克(indoxacarb)或滅伏美松(metaflumizone)。

(23)乙醯基-Co-A 羧酸酶之抑制劑，如，例如：季酮酸與吡咯酮酸衍生物，例如：螺克芬(spirodiclofen)、螺滅芬(spiromesifen)與賜派滅(spirotetramat)。

(24)複合物-IV 電子傳遞抑制劑，如，例如：磷類，例如：磷化鋁、磷化鈣、磷與磷化鋅；或氰化物。

(25)複合物-II 電子傳遞抑制劑，如，例如：氰必吩(cyenoxyfen)與賽芬蟎(cyflumetofen)。

(28)蘭尼鹼(ryanodine)受體效應劑，如，例如：二醯胺類，例如：氯蔥吡咯(chlorantraniliprole)、氰蟲醯胺(cyantraniliprole)與表氟蟲胺(flubendiamide)，

其他活性化合物，如，例如：艾特本(afidopyropen)、查得定(azadirachtin)、苯克賽(benclonthiaz)、苯賽滅(benzoximate)、必芬賽(bifenazate)、新殺蟎(bromopropylate)、蟎離丹(chinomethionat)、克利得(cryolite)、大克蟎(dicofol)、氟蟎四嗪(diflovidazin)、氟速吩(flusulfone)、氟喹啉(flometoquin)、伏吩靈(flufenerim)、氟菌蟎酯(flufenoxystrobin)、丁烯氟蟲腈(flufiprole)、氟吡菌醯胺(flupyram)、伏達隆(flupyradifurone)、呋喃蟲醯肼(fufenozide)、氯氟醚菊酯(heptafluthrin)、氯噻啉(imidaclothiz)、依普同(iprodione)、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、哌蟲啉(paichongding)、必伏拜(pyflubumide)、必伏松(pyrifluquinazon)、嘧蟎胺(pyriminostrobin)、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)與碘甲烷；及其他基於堅強芽孢桿菌(*Bacillus firmus*)之製劑(I-1582, BioNeem,

Votivo), 與下列化合物: 3-溴-N-{2-溴-4-氯-6-[(1-環丙基乙基)胺甲醯基]苯基}-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-羧醯胺(自 WO2005/077934 中已知)與 1-{2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亞磺醯基]苯基}-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺(自 WO2006/043635 中已知)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吡啶-3,4'-哌啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮(自 WO2003/106457 中已知)、2-氯-N-[2-{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]哌啶-4-基}-4-(三氟甲基)苯基]異菸鹼醯胺(自 WO2006/003494 中已知)、3-(2,5-二甲基苯基)-4-羥基-8-甲氧基-1,8-重氮螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(自 WO2009/049851 中已知)、碳酸 3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-側氧基-1,8-重氮螺[4.5]癸-3-烯-4-基-乙基酯(自 WO2009/049851 中已知)、4-(丁-2-炔-1-基氧)-6-(3,5-二甲基哌啶-1-基)-5-氟嘧啶(自 WO2004/099160 中已知)、4-(丁-2-炔-1-基氧)-6-(3-氯苯基)嘧啶(自 WO2003/076415 中已知)、PF1364 (CAS 登錄號 1204776-60-2)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-{2-側氧基-2-[(2,2,2-三氟乙基)胺基]乙基}苯甲醯胺(自 WO2005/085216 中已知)、4-{5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基}-N-{2-側氧基-2-[(2,2,2-三氟乙基)胺基]乙基}-1-萘甲醯胺(自 WO2009/002809 中已知)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}胺基)-5-氯-3-甲基苯甲醯基]-2-甲基胍羧酸甲酯(自 WO2005/085216 中已知)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}胺基)-5-氟基-3-甲基苯甲醯基]-2-乙基胍羧酸甲酯(自 WO2005/085216 中已知)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}胺基)-5-氟基-3-甲基苯甲醯基]-2-甲基胍羧酸甲酯(自 WO2005/085216 中已知)、2-[3,5-二溴-2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}胺基)苯甲醯基]-2-乙基胍羧酸甲酯(自 WO2005/085216 中已知)、1-(3-氯吡啶-2-基)-N-[4-氟基-2-甲基-6-(甲基胺甲醯基)苯基]-3-{[5-(三氟甲基)-2H-四唑-2-基]甲基}-1H-吡啶-5-羧醯胺(自 WO2010/069502 中已知)、N-[2-(5-胺基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-羧醯胺(自 CN102057925 中已知)、3-氯-N-(2-氟基丙烷-2-基)-N-[4-(1,1,1,2,3,3,3-七氟丙烷-2-基)-2-甲基苯基]酞醯胺(自 WO2012/034472 中已知)、8-氯-N-[(2-氯-5-甲氧基苯基)磺醯基]-6-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-羧醯胺(自 WO2010/129500 中已知)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基

-N-(1-氧硫雜環丁烷-3-基)苯甲醯胺(自 WO2009/080250 中已知)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-(1-氧硫雜環丁烷-3-基)苯甲醯胺(自 WO2012/029672 中已知)、1-[(2-氯-1,3-噻唑-5-基)甲基]-4-側氧基-3-苯基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶-1-鎊-2-醇酸鹽(自 WO2009/099929 中已知)、1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-4-側氧基-3-苯基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶-1-鎊-2-醇酸鹽(自 WO2009/099929 中已知)、(5S,8R)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-9-硝基-2,3,5,6,7,8-六氫-1H-5,8-環氧咪唑并[1,2-a]氮雜環庚烯(自 WO2010/069266 中已知)、(2E)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-N'-硝基-2-亞戊基胍甲脒(自 WO2010/060231 中已知)、4-(3-{2,6-二氯-4-[(3,3-二氯丙-2-烯-1-基)氧]苯氧基}丙氧基)-2-甲氧基-6-(三氟甲基)嘧啶(自 CN101337940 中已知)、N-[2-(第三丁基胺甲醯基)-4-氯-6-甲基苯基]-1-(3-氯吡啶-2-基)-3-(氟甲氧基)-1H-吡啶-5-羧醯胺(自 WO2008/134969 中已知)。

殺真菌劑

【0083】 本文中以其俗名稱呼之活性化合物為已知者且說明於例如：“農藥指南 (The Pesticide Manual) 或網際網路 (例如：<http://www.alanwood.net/pesticides>)。

(1)麥角固醇生合成抑制劑，如，例如：(1.1)艾狄莫(aldimorph)、(1.2)阿克唑(azaconazole)、(1.3)拜坦諾(bitertanol)、(1.4)布康唑(bromuconazole)、(1.5)西普康唑(cyproconazole)、(1.6)二氯丁唑(diclobutrazole)、(1.7)地吩康唑(difenoconazole)、(1.8)地康唑(diniconazole)、(1.9)地康唑-M(diniconazole-M)、(1.10)得莫(dodemorph)、(1.11)得莫乙酸鹽(dodemorph acetate)、(1.12)環氧克唑(epoxiconazole)、(1.13)抑達唑(etaconazole)、(1.14)芬利莫(fenarimol)、(1.15)芬康唑(fenbuconazole)、(1.16)吩醯胺(fenhexamide)、(1.17)芬普定(fenpropidin)、(1.18)芬普福(fenpropimorph)、(1.19)伏克康唑(fluquinconazole)、(1.20)伏米得(flurprimidol)、(1.21)護矽得(flusilazole)、(1.22)護汰芬(flutriafol)、(1.23)伏康唑(furconazole)、(1.24)順式伏康唑(furconazole-cis)、(1.25)赫康唑(hexaconazole)、(1.26)依滅列(imazalil)、(1.27)依滅列硫酸鹽(imazalil sulphate)、(1.28)抑本康唑(imibenconazole)、(1.29)抑普康唑(ipconazole)、(1.30)滅康唑(metconazole)、(1.31)麥克坦尼(myclobutanil)、(1.32)納得吩(naftifin)、(1.33)

紐莫(nuarimol)、(1.34)喹康唑(oxpoconazole)、(1.35)巴克素(paclobutrazole)、(1.36)比菲唑(pefurazoate)、(1.37)本康唑(penconazole)、(1.38)哌布靈(piperalin)、(1.39)撲克樂(prochloraz)、(1.40)普克利(propiconazole)、(1.41)普賽康唑(prothioconazole)、(1.42)必達克(pyributicarb)、(1.43)比芬斯(pyrifenoxy)、(1.44)克康唑(quinconazole)、(1.45)辛康唑(simeconazole)、(1.46)賜必安(spiroxamine)、(1.47)得克利(tebuconazole)、(1.48)特本吩(terbinafin)、(1.49)特康唑(tetraconazole)、(1.50)三泰芬(triadimefon)、(1.51)三泰隆(triadimenol)、(1.52)賽得莫(tridemorph)、(1.53)三伏唑(triflumizol)、(1.54)賽福寧(triforine)、(1.55)三狄康唑(triticonazole)、(1.56)優康唑(uniconazole)、(1.57)優康唑-P(uniconazol-p)、(1.58)芬克唑(viniconazole)、(1.59)福康唑(voriconazole)、(1.60)1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)環庚醇、(1.61)1-(2,2-二甲基-2,3-二氫-1H-茚-1-基)-1H-咪唑-5-羧酸甲酯、(1.62)N'-{5-(二氟甲基)-2-甲基-4-[3-(三甲基矽烷基)丙氧基]苯基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.63)N-乙基-N-甲基-N'-{2-甲基-5-(三氟甲基)-4-[3-(三甲基矽烷基)丙氧基]苯基}甲脒與(1.64)O-[1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁烷-2-基]-1H-咪唑-1-硫代甲酸酯、(1.65)啞菌唑(pyrissoxazole)。

(2)呼吸抑制劑(呼吸鏈抑制劑)，如，例如：(2.1)必賽吩(bixafen)、(2.2)保卡利(boscalid)、(2.3)卡布辛(carboxin)、(2.4)地伏滅靈(diflumerim)、(2.5)芬伏爛(fenfuram)、(2.6)護派楠(fluopyram)、(2.7)護坦尼(flutolanil)、(2.8)護賽保(fluxapyroxad)、(2.9)福滅普(furametpyr)、(2.10)福滅克(furmecyclox)、(2.11)抑本散(isopyrazam)之順-差向異構體消旋物 1RS,4SR,9RS 與反-差向異構體消旋物 1RS,4SR,9SR 混合物、(2.12)抑本散(isopyrazam)(反-差向異構體消旋物)、(2.13)抑本散(isopyrazam)(反-差向異構體對映異構物 1R,4S,9S)、(2.14)抑本散(isopyrazam)(反-差向異構體對映異構物 1S,4R,9R)、(2.15)抑本散(isopyrazam)(順-差向異構體消旋物 1RS,4SR,9RS)、(2.16)抑本散(isopyrazam)(順-差向異構體對映異構物 1R,4S,9R)、(2.17)抑本散(isopyrazam)(順-差向異構體對映異構物 1S,4R,9S)、(2.18)米普尼(mepronil)、(2.19)嘉得信(oxycarboxin)、(2.20)本福吩(penflufen)、(2.21)本賽能(penthiopyrad)、(2.22)速達散(sedaxane)、(2.23)地伏醯胺(thifluzamid)、(2.24)1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-羧醯胺、

(2.25)3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-1H-吡唑-4-羧醯胺、
 (2.26)3-(二氟甲基)-N-[4-氟-2-(1,1,2,3,3,3-六氟丙氧基)苯基]-1-甲基-1H-吡唑
 -4-羧醯胺、(2.27)N-[1-(2,4-二氯苯基)-1-甲氧基丙烷-2-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基
 -1H-吡唑-4-羧醯胺、(2.28)5,8-二氟-N-[2-(2-氟-4-{[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]氧}
 苯基)乙基]喹唑啉-4-胺、(2.29) 苯索伏比 (benzovindiflupyr)、
 (2.30)N-[(1S,4R)-9-(二氯亞甲基)-1,2,3,4-四氫-1,4-甲撐基萘-5-基]-3-(二氟甲
 基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺與(2.31)N-[(1R,4S)-9-(二氯亞甲基)-1,2,3,4-四氫
 -1,4-甲撐基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(2.32) 3-(二氟甲
 基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-羧醯胺、(2.33)
 1,3,5-三甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-羧醯胺、(2.34)
 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-羧醯胺、
 (2.35) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1H-吡
 唑-4-羧醯胺、(2.36) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛
 -4-基]-1H-吡唑-4-羧醯胺、(2.37) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基
 -2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-羧醯胺、(2.38) 3-(二氟甲基)-1-甲基
 -N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-羧醯胺、(2.39) 1,3,5-
 三甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-羧醯胺、(2.40)
 1,3,5-三甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-羧醯胺、
 (2.41) 麥鏽靈(benodanil)、(2.42) 2-氯-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)吡
 啶-3-羧醯胺、(2.43) 抑吩滅(isofetamid)。

(3)作用於呼吸鏈複合物 III 之呼吸抑制劑(呼吸鏈抑制劑)，如，例如：(3.1)辛
 啞啞菌胺(ametoctradin)、(3.2)安美速(amisulbrom)、(3.3)亞托敏(azoxystrobin)、
 (3.4)賽發滅(cyazofamid)、(3.5)甲香菌酯(coumethoxystrobin)、(3.6)丁香菌酯
 (coumoxystrobin)、(3.5)醚菌胺(dimoxystrobin)、(3.6)烯肱菌酯(enestroburin)、
 (3.9)芬色丹(famoxadone)、(3.10)芬滅酮(fenamidone)、(3.11)吩啞菌酯
 (fenoxystrobin)、(3.12)氟啞菌酯(fluxastrobin)、(3.13)甲基醚菌酯
 (kresoxim-methyl)、(3.14)苯氧菌胺(metominostrobin)、(3.15)肱醚菌胺
 (orysastrobin)、(3.16)啞氧菌酯(picoxystrobin)、(3.17)啞菌胺酯(pyraclostrobin)、
 (3.18)啞胺菌酯(pyrametostrobin)、(3.19)啞菌酯(pyraoxystrobin)、(3.20)吡菌苯
 威(pyribencarb)、(3.21)三氯比(triclopyricarb)、(3.22)三氟敏(trifloxystrobin)、

(3.23)(2E)-2-(2-{{6-(3-氯-2-甲基苯氧基)-5-氟嘧啶-4-基}氧}苯基)-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基乙醯胺、(3.24)(2E)-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基-2-(2-{{((1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亞乙基}胺基)氧}甲基}苯基)乙醯胺、(3.25)(2E)-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基-2-{2-[(E)-({1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基}亞胺基)甲基]苯基}乙醯胺、(3.26)(2E)-2-{2-[(E)-1-氟-2-苯基乙烯基]氧}苯基)亞乙基}胺基}氧}甲基]苯基}-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基乙醯胺、(3.27)(2E)-2-{2-[(E)-4-(2,6-二氯苯基)亞丁-3-烯-2-基]胺基}氧}甲基]苯基}-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基乙醯胺、(3.28)2-氯-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-節-4-基)吡啶-3-羧醯胺、(3.29)5-甲氧基-2-甲基-4-(2-{{((1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亞乙基}胺基)氧}甲基}苯基)-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-酮、(3.30)(2E)-2-{2-[(環丙基[(4-甲氧基苯基)亞胺基]甲基]氫硫基)甲基]苯基}-3-甲氧基丙-2-烯酸甲酯、(3.31)N-(3-乙基-3,5,5-三甲基環己基)-3-(甲醯基胺基)-2-羥基苯甲醯胺、(3.32)2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙醯胺。

(4)有絲分裂與細胞分化之抑制劑，如，例如：(4.1)免賴德(benomyl)、(4.2)卡苯辛(carbendazim)、(4.3)氯吩唑(chlorfenazole)、(4.4)地吩卡(diethofencarb)、(4.5)噻唑菌胺(ethaboxam)、(4.6)氟吡菌胺(flupicolide)、(4.7)伏塔唑(fuberidazole)、(4.8)賓克隆(pencycuron)、(4.9)腐絕(thiabendazole)、(4.10)甲基多保淨(thiophanate-methyl)、(4.11)多保淨(thiophanate)、(4.12)索醯胺(zoxamide)、(4.13)5-氯-7-(4-甲基吡啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶與(4.14)3-氯-5-(6-氯吡啶-3-基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)嗒吡。

(5)具有多重位點活性之化合物，如，例如：(5.1)波爾多(Bordeaux)混合物、(5.2)四氯丹(captafol)、(5.3)蓋普丹(captan)、(5.4)四氯異苯腈(chlorothalonil)、(5.5)銅製劑，如：氫氧化銅、(5.6)萘甲酸銅、(5.7)氧化銅、(5.8)鹼性氫氧化銅、(5.9)硫酸銅、(5.10)益發靈(dichlofluanid)、(5.11)腈硫醯(dithianon)、(5.12)多寧(dodine)、(5.13)多寧游離鹼、(5.14)富爾邦(ferbam)、(5.15)護福爾培(fluorfolpet)、(5.16)福爾培(folpet)、(5.17)免熱淨(guazatine)、(5.18)免熱淨乙酸鹽(guazatine acetate)、(5.19)抑克定(iminoctadine)、(5.20)抑克定苯烷磺酸鹽(iminoctadine albesilate)、(5.21)抑克定(iminoctadine)三乙酸鹽、(5.22)錳銅(mancopper)、(5.23)錳粉克(mancozeb)、(5.24)錳乃浦(maneb)、(5.25)滅得賴(metiram)、(5.26)滅得

賴鋅鹽、(5.27)快得寧(copper-oxine)、(5.28)丙氧苯脒(propamidine)、(5.29)甲基鋅乃浦(propineb)、(5.30)硫與硫製劑，如，例如：多硫化鈣、(5.31)得恩地(thiram)、(5.32)特伏奈(tolylfluanid)、(5.33)鋅乃浦(zineb)、(5.34)益穗(ziram)與(5.35)敵菌靈(anilazine)。

(6)抗性誘發劑，如，例如：(6.1)阿拉酸式苯(acibenzolar)-S-甲基、(6.2)異噻菌胺(isotianil)、(6.3)撲殺熱(probenazole)、(6.4)地得尼(tiadinil)與(6.5)昆布多醣(laminarin)。

(7)胺基酸與蛋白質生合成抑制劑，如，例如：(7.1)、(7.2)保米黴素(blasticidin-S)、(7.3)嘔菌環胺(cyprodinil)、(7.4)賜黴素(kasugamycin)、(7.5)賜黴素鹽酸鹽水合物(kasugamycin hydrochloride hydrate)、(7.6)米本靈(mepanipyrim)、(7.7)比坦尼(pyrimethanil)、(7.8)3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)喹啉、與(7.9)土黴素(oxytetracycline)與(7.10)鏈黴素(streptomycin)。

(8)ATP 生產抑制劑，如，例如：(8.1)三苯醋錫(fentin acetate)、(8.2)三苯氯錫(fentin chloride)、(8.3)三苯錫氫氧化物(fentin hydroxide)與(8.4)矽硫吩(silthiofam)。

(9)細胞壁合成抑制劑，如，例如：(9.1)苯賽卡(benthiavalicarb)、(9.2)地滅莫(dimethomorph)、(9.3)伏莫(flumorph)、(9.4)抑發利(iprovalicarb)、(9.5)曼普胺(mandipropamid)、(9.6)保粒黴素(polyoxins)、(9.7)保粒靈(polyoxorim)、(9.8)瓦利黴素(validamycin A)、(9.9)發利列(valifenalate)與(9.10)保粒黴素(polyoxin)B。

(10)脂質與膜合成抑制劑，如，例如：(10.1)聯苯、(10.2)地茂散(chloroneb)、(10.3)大克爛(dicloran)、(10.4)護粒松(edifenphos)、(10.5)依得利(etridiazole)、(10.6)碘卡(iodocarb)、(10.7)丙基喜樂松(iprobenfos)、(10.8)亞賜普醇烷(isoprothiolane)、(10.9)普莫卡(propamocarb)、(10.10)普莫卡鹽酸鹽(propamocarb hydrochloride)、(10.11)硫菌威(prothiocarb)、(10.12)白粉松(pyrazophos)、(10.13)五氯硝苯(quintozene)、(10.14)四氯硝苯(tecnazene)與(10.15)特克斯-甲基(tolclofos-methyl)基。

(11)黑色素生合成抑制劑，如，例如：(11.1)卡普醯胺(capropamid)、(11.2)地克賽(diclocymet)、(11.3)芬散尼(fenoxanil)、(11.4)太得(fthalide)、(11.5)百快隆(pyroquilon)、(11.6)三賽唑(tricyclazole)與(11.7){3-甲基-1-[(4-甲基苯甲醯基)

胺基]丁烷-2-基}胺甲酸 2,2,2-三氟乙基酯。

(12)核酸合成抑制劑，如，例如：(12.1)本達樂(benalaxyl)、(12.2)本達樂-M(benalaxyl-M)(克拉利(kiralaxyl))、(12.3)布滅莫(bupirimate)、(12.4)克拉肯(clozylacon)、(12.5)地滅利(dimethirimol)、(12.6)抑利莫(ethirimol)、(12.7)伏拉希(furalaxyl)、(12.8)殺紋寧(hymexazol)、(12.9)滅達樂(metalaxyl)、(12.10)滅達樂-M(metalaxyl-M)(滅芬散(mefenoxam))、(12.11)歐弗斯(ofurace)、(12.12)歐殺斯(oxadixyl)、(12.13)喹啉酸(oxolinic acid)與(12.14)歐奇農(octhilinone)。

(13)訊號轉導抑制劑，如，例如：(13.1)氯唑內(chlozolate)、(13.2)拌種咯(fenpiclonil)、(13.3)護汰寧(fludioxonil)、(13.4)依普同(iprodione)、(13.5)撲滅寧(procymidone)、(13.6)快諾芬(quinoxyfen)、(13.7)免克寧(vinclozolin)與(13.8)丙氧喹啉(proquinazid)。

(14)去偶合劑，如，例如：(14.1)百蟎克(binapacryl)、(14.2)白粉克(dinocap)、(14.3)富米松(ferimzone)、(14.4)扶吉胺(fluzinam)與(14.5)敵蟎普(meptyldinocap)。

(15)其他化合物，如，例如：(15.1)本塞唑(benthizole)、(15.2)苯喹啉(bethoxazine)、(15.3)卡普黴素(capsimycin)、(15.4)卡吩(carvone)、(15.5)喹啉甲硫胺酸鹽(chinomethionat)、(15.6)必伏農(pyriofenone)(克吩農(chlazafenon))、(15.7)庫發尼(cufraneb)、(15.8)賽伏醯胺(cyflufenamid)、(15.9)西莫尼(cymoxanil)、(15.10)環丙磺草胺(cyprosulfamide)、(15.11)邁隆(dazomet)、(15.12)迪布卡(debacarb)、(15.13)二氯吩(dichlorophen)、(15.14)地克美辛(diclomezine)、(15.15)地吩唑克(difenzoquat)、(15.16)地吩唑克甲基硫酸鹽、(15.17)二苯基胺、(15.18)抑克滅(EcoMate)、(15.19)吩普胺(fenpyrazamine)、(15.20)伏特夫(flumetover)、(15.21)氟菌丹(fluoromid)、(15.22)護硫醯胺(flusulphamide)、(15.23)噻菌淨(flutianil)、(15.24)福賽得鋁(fosetyl-aluminium)、(15.25)福賽得鈣(fosetyl-calcium)、(15.26)福賽得鈉(fosetyl-sodium)、(15.27)六氯苯、(15.28)依麻黴素(irumamycin)、(15.29)滅速卡(methasulfocarb)、(15.30)異硫氰酸甲酯、(15.31)滅奇吩(metrafenone)、(15.32)米德黴素(mildiomycin)、(15.33)納坦黴素(natamycin)、(15.34)二甲基二硫代胺甲酸鎳、(15.35)硝基太(nitrothal)-異丙基、(15.36)歐奇農(octhilinone)、(15.37)歐賽保(oxamocarb)、(15.38)歐芬汀(oxyfenthiin)、(15.39)五氯酚與其鹽類、(15.40)酚丁滅蟲(phenothrin)、(15.41)磷酸與其鹽類、(15.42)霜黴威乙膦酸

鹽(propamocarb-fosetylalate)、(15.43)普辛(propanosine)-鈉、(15.44)丁吡嗎啉(pyrimorph)、(15.45)(2E)-3-(4-第三丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(嗎啉-4-基)丙-2-烯-1-酮、(15.46)(2Z)-3-(4-第三丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(嗎啉-4-基)丙-2-烯-1-酮、(15.47)吡咯靈(pyrrolnitrin)、(15.48)美爾奎寧(tebufloquin)、(15.49)特克爛(tecloftalam)、(15.50)特伏尼(tolnifanid)、(15.51)三唑氧(triazoxide)、(15.52)三氯醯胺(trichlamide)、(15.53)奇利醯胺(zarilamid)、(15.54) 2-甲基丙酸(3S,6S,7R,8R)-8-苯甲基-3-[(3-[(異丁醯基氧)甲氧基]-4-甲氧基吡啶-2-基]羰基)胺基]-6-甲基-4,9-二側氧基-1,5-二氧雜環壬烷-7-基酯、(15.55) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]乙酮、(15.56) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]乙酮、(15.57) 1-(4-{4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]乙酮、(15.58) 1H-咪唑-1-羧酸 1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁烷-2-基酯、(15.59) 2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺醯基)吡啶、(15.60) 2,3-二丁基-6-氯噻吩并[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮、(15.61) 2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二硫吡并[2,3-c:5,6-c']二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮、(15.62) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]-1-(4-{4-[(5R)-5-苯基-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)乙酮、(15.63) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]-1-(4-{4-[(5S)-5-苯基-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)乙酮、(15.64) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]-1-{4-[4-(5-苯基-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基)-1,3-噻唑-2-基]哌啶-1-基}乙酮、(15.65) 2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4H-色烯-4-酮、(15.66) 2-氯-5-[2-氯-1-(2,6-二氟-4-甲氧基苯基)-4-甲基-1H-咪唑-5-基]吡啶、(15.67) 2-苯基苯酚與鹽類、(15.68) 3-(4,4,5-三氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)喹啉、(15.69) 3,4,5-三氯吡啶-2,6-二甲腈、(15.70) 3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基嗒吡、(15.71) 4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基嗒吡、(15.72) 5-胺基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇、(15.73) 5-氯-N'-苯基-N'-(丙-2-炔-1-基)噻吩-2-亞硫羧基醯肼、(15.74) 5-氟-2-[(4-氟苯基)氧]嘧啶-4-胺、(15.75) 5-氟-2-[(4-甲基苯基)氧]嘧啶-4-胺、(15.76) 5-甲基-6-辛基[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-7-胺、(15.77) (2Z)-3-胺基-2-氯基-3-苯基丙烯酸乙酯、(15.78) N'-(4-{3-(4-氯苯基)-1,2,4-噻二唑

-5-基]氧}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.79) N-(4-氯苯甲基)-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧)苯基]丙醯胺、(15.80)N-[(4-氯苯基)(氰基)甲基]-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧)苯基]丙醯胺、(15.81) N-[(5-溴-3-氯吡啶-2-基)甲基]-2,4-二氯菸醯胺、(15.82) N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯菸醯胺、(15.83) N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2-氟-4-碘菸醯胺、(15.84) N-{(E)-[(環丙基甲氧基)亞胺基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苯基乙醯胺、(15.85) N-{(Z)-[(環丙基甲氧基)亞胺基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苯基乙醯胺、(15.86) N'-{4-[(3-第三丁基-4-氰基-1,2-噁唑-5-基)氧]-2-氯-5-甲基苯基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.87) N-甲基-2-(1-{{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]乙醯基}哌啶-4-基)-N-(1,2,3,4-四氫萘-1-基)-1,3-噁唑-4-羧醯胺、(15.88) N-甲基-2-(1-{{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]乙醯基}哌啶-4-基)-N-[(1R)-1,2,3,4-四氫萘-1-基]-1,3-噁唑-4-羧醯胺、(15.89) N-甲基-2-(1-{{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]乙醯基}哌啶-4-基)-N-[(1S)-1,2,3,4-四氫萘-1-基]-1,3-噁唑-4-羧醯胺、(15.90) {6-[[{(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亞甲基]胺基}氧]甲基]吡啶-2-基}胺甲酸戊酯、(15.91)吩吡-1-羧酸、(15.92) 喹啉-8-醇、(15.93) 喹啉-8-醇硫酸酯(2:1)、(15.94) {6-[[{(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亞甲基]胺基}氧]甲基]吡啶-2-基}胺甲酸第三丁基酯、(15.95) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[2'-(三氟甲基)聯苯-2-基]-1H-吡啶-4-羧醯胺、(15.96) N-(4'-氯聯苯-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(15.97) N-(2',4'-二氯聯苯-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(15.98) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(三氟甲基)聯苯-2-基]-1H-吡啶-4-羧醯胺、(15.99) N-(2',5'-二氯聯苯-2-基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-4-羧醯胺、(15.100) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)聯苯-2-基]-1H-吡啶-4-羧醯胺、(15.101) 5-氟-1,3-二甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)聯苯-2-基]-1H-吡啶-4-羧醯胺、(15.102) 2-氯-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)聯苯-2-基]菸醯胺、(15.103) 3-(二氟甲基)-N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)聯苯-2-基]-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(15.104) N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)聯苯-2-基]-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(15.105) 3-(二氟甲基)-N-(4'-乙炔基聯苯-2-基)-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(15.106) N-(4'-乙炔基聯苯-2-基)-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(15.107) 2-氯-N-(4'-乙炔基聯苯-2-基)菸醯胺、(15.108) 2-氯-N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)聯苯-2-基]菸醯胺、

(15.109) 4-(二氟甲基)-2-甲基-N-[4'-(三氟甲基)聯苯-2-基]-1,3-噻唑-5-羧醯胺、
 (15.110) 5-氟-N-[4'-(3-羥基-3-甲基丁-1-炔-1-基)聯苯-2-基]-1,3-二甲基-1H-吡
 啶-4-羧醯胺、(15.111) 2-氯-N-[4'-(3-羥基-3-甲基丁-1-炔-1-基)聯苯-2-基]菸醯
 胺、(15.112) 3-(二氟甲基)-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)聯苯-2-基]-1-
 甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(15.113) 5-氟-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)聯
 苯-2-基]-1,3-二甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(15.114) 2-氯-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基
 丁-1-炔-1-基)聯苯-2-基]菸醯胺、(15.115) (5-溴-2-甲氧基-4-甲基吡啶-3-
 基)(2,3,4-三甲氧基-6-甲基苯基)甲酮、(15.116) N-[2-(4-{[3-(4-氯苯基)丙-2-炔
 -1-基]氧}-3-甲氧基苯基)乙基]-N2-(甲基磺醯基)纈醯胺、(15.117) 4-側氧基
 -4-[(2-苯基乙基)胺基]丁酸、(15.118) {6-[(Z)-(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)
 亞甲基]胺基}氧)甲基吡啶-2-基}胺甲酸丁-3-炔-1-基酯、(15.119) 4-胺基-5-氟
 嘧啶-2-醇(互變異構型：4-胺基-5-氟嘧啶-2(1H)-酮)、(15.120) 3,4,5-三羥基苯
 甲酸丙酯、(15.121) 1,3-二甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)-1H-吡啶
 -4-羧醯胺、(15.122) 1,3-二甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1H-
 吡啶-4-羧醯胺、(15.123) 1,3-二甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-
 基]-1H-吡啶-4-羧醯胺、(15.124) [3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑
 -4-基](吡啶-3-基)甲醇、(15.125) (S)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-
 噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(15.126) (R)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯
 基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(15.127) 2-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)
 環氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.128) 硫代氰酸
 1-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基酯、
 (15.129) 5-(烯丙基氫硫基)-1-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]
 甲基}-1H-1,2,4-三唑、(15.130) 2-[1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-
 基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.131) 2-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯
 基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、
 (15.132) 2-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲
 基}-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.133) 硫代氰酸 1-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯
 苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基酯、(15.134)
 硫代氰酸 1-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲
 基}-1H-1,2,4-三唑-5-基酯、(15.135) 5-(烯丙基氫硫基)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯

基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(15.136) 5-(烯丙基氫
 硫基)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲
 基}-1H-1,2,4-三唑、(15.137) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲
 基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.138) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-二
 氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、
 (15.139) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二
 氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.140) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基
 -2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.141)
 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫
 -3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.142) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-
 三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.143)
 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫
 -3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.144) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-
 三甲基庚烷-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(15.145) 2-氟-6-(三氟甲
 基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)苯甲醯胺、(15.146) 2-(6-苯甲基吡啶
 -2-基)喹啉、(15.147) 2-[6-(3-氟-4-甲氧基苯基)-5-甲基吡啶-2-基]喹啉、
 (15.148) 3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)喹啉、(15.149) 脫落酸、
 (15.150) 3-(二氟甲基)-N-甲氧基-1-甲基-N-[1-(2,4,6-三氯苯基)丙烷-2-基]-1H-
 吡啶-4-羧醯胺、(15.151) N'-[5-溴-6-(2,3-二氫-1H-茛-2-基氧)-2-甲基吡啶-3-
 基]-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.152) N'-{5-溴-6-[1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基
 吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.153) N'-{5-溴-6-[(1R)-1-(3,5-二氟苯基)乙
 氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.154) N'-{5-溴-6-[(1S)-1-(3,5-
 二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.155) N'-{5-溴
 -6-[(順式-4-異丙基環己基)氧]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.156)
 N'-{5-溴-6-[(反式-4-異丙基環己基)氧]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基甲脒、
 (15.157) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-異丙基苯甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-
 羧醯胺、(15.158) N-環丙基-N-(2-環丙基苯甲基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-
 吡啶-4-羧醯胺、(15.159) N-(2-第三丁基苯甲基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟
 -1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(15.160) N-(5-氯-2-乙基苯甲基)-N-環丙基-3-(二氟
 甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-羧醯胺、(15.161) N-(5-氯-2-異丙基苯甲基)-N-環

丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(15.162) N-環丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-氟苯基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(15.163) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(5-氟-2-異丙基苯基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(15.164) N-環丙基-N-(2-環丙基-5-氟苯基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(15.165) N-(2-環戊基-5-氟苯基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(15.166) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-氟-6-異丙基苯基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(15.167) N-環丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-甲基苯基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(15.168) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-異丙基-5-甲基苯基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(15.169) N-環丙基-N-(2-環丙基-5-甲基苯基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(15.170) N-(2-第三丁基-5-甲基苯基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(15.171) N-[5-氯-2-(三氟甲基)苯基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(15.172) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-N-[5-甲基-2-(三氟甲基)苯基]-1H-吡唑-4-羧醯胺、(15.173) N-[2-氯-6-(三氟甲基)苯基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(15.174) N-[3-氯-2-氟-6-(三氟甲基)苯基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(15.175) N-環丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-4,5-二甲基苯基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(15.176) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-異丙基苯基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧硫醯胺、(15.177) 3-(二氟甲基)-N-(7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(15.178) 3-(二氟甲基)-N-[(3R)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(15.179) 3-(二氟甲基)-N-[(3S)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺、(15.180) N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.181) N'-{4-[(4,5-二氯-1,3-噁唑-2-基)氧]-2,5-二甲基苯基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.182) N-(4-氯-2,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺。所有第(1)至(15)類所述之混合組份依據其官能基而定，可視需要與合適酸或鹼形成鹽類。

作為混合組份之生物性殺蟲劑

【0084】 式(I)化合物可與生物性殺蟲劑組合。

【0085】 生物性殺蟲劑特定言之包括細菌、真菌、酵母、植物抽出物及微生物製品，包括蛋白質與二次代謝物。

【0086】 生物性殺蟲劑包括細菌，如：形成孢子之細菌、定殖在根部之細菌及具有生物性殺昆蟲劑、殺真菌劑或殺線蟲劑作用之細菌。

作為混合組份之安全劑

【0087】 式(I)化合物可與安全劑組合，如，例如：解草酮(benoxacor)、解毒啞(cloquintocet (-mexyl))、解草胺腈(cyometrinil)、環丙磺草胺(cyprosulfamide)、二氯丙烯胺(dichlormid)、解草啞(fenchlorazole)(-乙基)、解草啞(fenclorim)、解草安(flurazole)、氟草肟(fluxofenim)、解草啞唑(furilazole)、雙苯啞唑酸(isoxadifen(-ethyl))、吡啞解草酯(mefenpyr (-diethyl))、萘甲酸酐、解草腈(oxabetrinil)、2-甲氧基-N-({4-[(甲基胺甲醯基)胺基]苯基}磺醯基)苯甲醯胺(CAS 129531-12-0)、4-(二氯乙醯基)-1-氧雜-4-氮雜螺[4.5]癸烷(CAS 71526-07-3)、2,2,5-三甲基-3-(二氯乙醯基)-1,3-啞唑啞(CAS 52836-31-4)。

植物與植株部份

【0088】 所有植物與植株部份均可根據本發明處理。此時，咸瞭解植物係指所有植物及植株部份，如：需要及不需要之野生植物或作物(包括天然作物)，例如：穀類(小麥、稻、硬粒小麥、大麥、裸麥、燕麥)、玉米、大豆、馬鈴薯、甜菜、甘蔗、番茄、豆與其他蔬菜類、棉花、菸草、油菜、與果實植物(蘋果、梨、柑橘類果實與葡萄)。作物可為得自依傳統育種法與最適化方法或利用生物技術與遺傳工程法或此等方法之組合所取得者，包括轉殖基因植物，及包括受植物育種者權益保護或未受保護之植物栽培品種。咸瞭解，植株部份意指植物之所有地上及地下部份與器官，如：芽、葉、花與根，其實例可述及：闊葉、針葉、莖、樹幹、花、果實體、果實、種子，及球莖、根與根莖。植株部份亦包括收成之植物，與無性及有性繁殖材料，例如：扦插、球莖、根莖、插枝與種子。

轉殖基因植物、種子處理法與整合品項

【0089】 根據本發明處理之較佳轉殖基因植物或植物栽培品種(彼等由遺傳工程取得者)包括所有透過基因改造過程，接受賦與特別有利性質(「性狀」)之遺傳物質之植物。此等性質實例為改善植物生長、提高對高溫或低溫之耐受性、提高對乾旱或對水含量或土壤鹽含量之耐受性、提高開花率、簡化收成、加速成熟、提高收成量、提高所收成產品之品質與/或提高營養價值、更佳儲存壽命與/或提高所收成產品之可加工性。其他及特別強調之此等性質實例為植物對抗動物害蟲與有害微生物之更佳防禦性，如：由例如：植物內所形成之毒素，特定言之由來自蘇雲金芽孢桿菌(*Bacillus thuringiensis*)之遺傳物質(例如：基因 CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c Cry2Ab、Cry3Bb 與 CryIF 及其組合)於植物中產生之毒素來對抗昆蟲、蜘蛛、線蟲、蟎類、蛭蟪與蝸牛，進一步提高植物對抗植病原性真菌、細菌與/或病毒之抗性。

作物保護-處理型態

【0090】 使用式(I)化合物處理植物與植株部份之方法係依傳統處理法直接處理或使化合物作用在其周圍、環境或庫存空間，例如：浸泡、噴灑、噴霧、灌注、蒸發、撒粉、霧化、撒播、起泡、塗刷、散播、注射、澆水(澆淋)、滴灌，若處理繁殖材料時，特定言之處理種子時，可進一步為供乾式處理種子之粉末、濕式處理種子之溶液、漿式處理種子之水溶性粉末、包殼、塗佈一層或多層包衣，等等。亦可進一步採用超低體積法施用式(I)化合物或取施用型式或式(I)化合物本身注射至土壤中。

種子處理

【0091】 長久以來已知藉由處理植物種子來控制動物害蟲且仍在改良中。然而，處理種子時，經常出現一些無法以令人滿意之方式解決之問題。因此需要發展一種保護種子及發芽植物之方法，其可以在儲存期間、播種後或植物發芽後免除或至少顯著減少另外施用殺蟲劑。亦需要使活性化合物以最適當用量提供種子及發芽植物最佳保護程度，以免動物害蟲侵害，且不受所使

用活性化合物傷害植物本身。特定言之，處理種子之方法亦應考量可抵抗或耐受害蟲之轉殖基因植物固有之殺昆蟲或殺線蟲性質，以便在最低之殺蟲劑用量下，對種子及發芽植物達最佳當保護程度。

【0092】 特定言之，本發明因此亦有關一種使用一種式(I)化合物處理種子，以保護種子與發芽植物免於害蟲侵害之方法。根據本發明保護種子與發芽植物免於害蟲侵害之方法亦包括以式(I)化合物與混合組份在一次操作中同時處理或依序處理之方法。亦包括以式(I)化合物與混合組份在不同時間處理種子之方法。

【0093】 本發明同樣係有關一種以式(I)化合物於處理種子上之用途，以保護種子與發芽植物免於動物害蟲侵害。

動物健康

【0094】 在動物健康方面(亦即獸醫學領域)，式(I)化合物可活性對抗動物寄生蟲，特定言之體外寄生蟲或體內寄生蟲。術語「體內寄生蟲」尤其包括蠕蟲與原蟲，如：球蟲目(Coccidia)。體外寄生蟲通常且較佳為節肢動物，特定言之昆蟲與蜱蟎類。

【0095】 在獸醫學領域中，對恆溫動物具有有利毒性之式(I)化合物適合在畜牧、養殖業、動物園、實驗室、實驗與家畜動物中控制出現在動物養殖及動物畜養中之寄生蟲。其可活性對抗寄生蟲之所有或特定發展階段。

【0096】 農業牲畜包括例如：哺乳動物，如：綿羊、山羊、馬、驢、駱駝、水牛、兔子、馴鹿、黓鹿及尤指牛與豬，或禽類，如：火雞、鴨、鵝，及尤指雞；魚類或甲殼類，例如：水產養殖，及昆蟲，如：蜜蜂。

【0097】 家畜動物包括例如：哺乳動物，如：倉鼠、天竺鼠，大鼠、小鼠、栗鼠、雪貂，及特定言之狗、貓、籠內的鳥、爬蟲類、兩棲類或水族箱內的魚。

【0098】 根據較佳具體實施例，式(I)化合物係投與哺乳動物。

【0099】 根據另一項較佳具體實施例，式(I)化合物係投與鳥類，亦即籠內的鳥，且尤指禽類。

【0100】 使用式(I)化合物控制動物寄生蟲，係計畫降低或防止生病、死亡例及下降之效能(指肉品、乳品、毛、皮、蛋、蜂蜜，等等)，因此可以達到更經濟及更簡單之動物管理及更佳之動物效益。

【0101】 在動物健康之相關領域中，術語「控制」或「防治」係指該等式(I)化合物可有效降低各寄生蟲在感染此等寄生蟲之動物中之發病率，使此等寄生蟲降至無害程度。更明確言之，本文所採用之「控制」係指該等式(I)化合物可以殺死各寄生蟲、抑制其生長或抑制其繁殖。

節肢動物包括：

蝨目(Anoplurida)，例如：盲蝨屬(*Haematopinus* spp.)、長顎蝨屬(*Linognathus* spp.)、蝨蟎屬(*Pediculus* spp.)、陰蝨屬(*Phtirus* spp.)、管蝨屬(*Solenopotes* spp.)；食毛目(Mallophagida)及鈍角亞目(Amblycerina)與細角亞目(Ischnocerina)，例如：毛鳥蝨屬(*Trimenopon* spp.)、雞蝨屬(*Menopon* spp.)、巨毛蝨屬(*Trinoton* spp.)、羽蝨屬(*Bovicola* spp.)、嚼蝨屬(*Werneckiella* spp.)、毛虱屬(*Lepikentron* spp.)、食蟲虻屬(*Damalina* spp.)、獸鳥蝨屬(*Trichodectes* spp.)、貓羽蝨屬(*Felicola* spp.)；雙翅目(Diptera)及長角亞目(Nematocerina)與短角亞目(Brachycerina)，例如：伊蚊屬(*Aedes* spp.)、按蚊屬(*Anopheles* spp.)、庫蚊屬(*Culex* spp.)、蚋蚊屬(*Simulium* spp.)、真蚋屬(*Eusimulium* spp.)、白蛉屬(*Phlebotomus* spp.)、沙蠅屬(*Lutzomyia* spp.)、蚊屬(*Culicoides* spp.)、斑虻屬(*Chrysops* spp.)、蚋屬(*Odagmia* spp.)、維蚋屬(*Wilhelmia* spp.)、瘤虻屬(*Hybomitra* spp.)、黃虻屬(*Atylotus* spp.)、虻屬(*Tabanus* spp.)、麻翅虻屬(*Haematopota* spp.)、*Philipomyia* 屬、蜂虱屬(*Braula* spp.)、家蠅屬(*Musca* spp.)、齒股蠅屬(*Hydrotaea* spp.)、螻蠅屬(*Stomoxys* spp.)、血蠅屬(*Haematobia* spp.)、莫蠅屬(*Morellia* spp.)、廐蠅屬(*Fannia* spp.)、舌蠅屬(*Glossina* spp.)、麗蠅屬(*Calliphora* spp.)、綠蠅屬(*Lucilia* spp.)、金蠅屬(*Chrysomyia* spp.)、肉蠅屬(*Wohlfahrtia* spp.)、麻蠅屬(*Sarcophaga* spp.)、狂蠅屬(*Oestrus* spp.)、皮蠅屬(*Hypoderma* spp.)、胃蠅屬(*Gasterophilus* spp.)、蝨蠅屬(*Hippobosca* spp.)、蝨蠅屬(*Lipoptena* spp.)、羊蝨蠅屬(*Melophagus* spp.)、鼻狂蠅屬(*Rhinoestrus* spp.)、大蚊屬(*Tipula* spp.)；蚤目(Siphonaptera)，例如：蚤屬(*Pulex* spp.)、櫛頭蚤屬(*Ctenocephalides* spp.)、潛蚤屬(*Tunga* spp.)、鼠蚤屬(*Xenopsylla* spp.)、角葉蚤屬(*Ceratophyllus* spp.)；異翅目(Heteropterida)，例如：臭蟲屬(*Cimex* spp.)、錐蝨屬(*Triatoma* spp.)、紅

腹獵蝱屬(*Rhodnius* spp.)、金圓蝱屬(*Panstrongylus* spp.)；及蜚蠊目(*Blattaria*)之擾人及衛生害蟲。

節肢動物進一步包括：

蜱蟲(*Acari*)之亞綱(蜱蟎亞綱(*Acarina*))及後氣亞目(*Metastigmata*)，例如：軟蜱科(*Argasidae*)，如：銳緣蜱屬(*Argas* spp.)、鈍緣蜱屬(*Ornithodoros* spp.)、殘緣蜱屬(*Otobius* spp.)；硬蜱科(*Ixodidae*)，如：硬蜱屬(*Ixodes* spp.)、花蜱屬(*Amblyomma* spp.)、扇頭蜱(*Rhipicephalus*(牛蜱(*Boophilus*))屬、革蜱屬(*Dermacentor* spp.)、血蜱屬(*Haemophysalis* spp.)、璃眼蜱屬(*Hyalomma* spp.)、扇頭蜱屬(*Rhipicephalus* spp.)(多重宿主蜱之原始屬種)；中氣亞目(*Mesostigmata*)，如：刺皮蟎屬(*Dermanyssus* spp.)、禽刺蟎屬(*Ornithonyssus* spp.)、肺刺蟎屬(*Pneumonyssus* spp.)、耳蟎屬(*Railletia* spp.)、肺刺蟎屬(*Pneumonyssus* spp.)、胸孔蟎屬(*Sternostoma* spp.)、瓦蟎屬(*Varroa* spp.)、蜂蟎屬(*Acarapis* spp.)；光芒蟲亞目(*Actinedida*)(前氣亞目(*Prostigmata*))，例如：蜂蟎屬(*Acarapis* spp.)、姬螯蟎屬(*Cheyletiella* spp.)、禽螯蟎屬(*Ornithocheyletia* spp.)、肉蟎屬(*Myobia* spp.)、綿羊疥蟎(*Psorergates* spp.)、脂蟎屬(*Demodex* spp.)、恙蟎屬(*Trombicula* spp.)、新恙蟎屬(*Neotrombicula* spp.)、螯蟎屬(*Listrophorus* spp.)；及粉蟎亞目(*Acaridida*)(無氣亞目(*Astigmata*))，例如：粉蟎屬(*Acarus* spp.)、食酪蟎屬(*Tyrophagus* spp.)、嗜木蟎屬(*Caloglyphus* spp.)、皮頸下蟎屬(*Hypodectes* spp.)、翼衣屬(*Pterolichus* spp.)、癢蟎屬(*Psoroptes* spp.)、皮蟎屬(*Chorioptes* spp.)、耳蟎屬(*Otodectes* spp.)、疥蟎屬(*Sarcoptes* spp.)、耳蟎屬(*Notoedres* spp.)、鳥疥蟎屬(*Knemidocoptes* spp.)、雞蟎屬(*Cytodites* spp.)、雞雛蟎屬(*Laminosioptes* spp.)

寄生性原蟲實例包括：

鞭毛門(*Mastigophora*)(鞭毛動物綱(*Flagellata*))，例如：錐蟲科(*Trypanosomatidae*)，例如：布氏錐蟲(*Trypanosoma b. brucei*)、布氏剛比亞錐蟲(*T.b. gambiense*)、布氏羅德西亞錐蟲(*T.b. rhodesiense*)、剛果錐蟲(*T. congolense*)、克氏錐蟲(*T. cruzi*)、伊氏錐蟲(*T. evansi*)、馬錐蟲(*T. equinum*)、路易氏錐蟲(*T. lewisi*)、鱸魚錐蟲(*T. percae*)、猿猴錐蟲(*T. simiae*)、活動錐蟲(*T. vivax*)、巴西利什曼原蟲(*Leishmania brasiliensis*)、杜氏利什曼原蟲(*L. donovani*)、熱帶利什曼原蟲(*L. tropica*)，如，例如：毛滴蟲科(*Trichomonadidae*)，例如：藍氏賈第鞭毛蟲(*Giardia lamblia*)、犬賈第鞭毛蟲(*G. canis*)

肉質鞭毛蟲門(Sarcomastigophora)(根足蟲綱(Rhizopoda))，如：內阿米巴科(Entamoebidae)，例如：溶組織內阿米巴(*Entamoeba histolytica*)、哈曼原蟲(Hartmanellidae)，例如：棘阿米巴屬(*Acanthamoeba* sp.)、哈曼原蟲屬(*Harmanella* sp.)

頂複合器門(Apicomplexa)(孢子蟲綱(Sporozoa))，如：艾美球蟲科(Eimeridae)，例如：雞球蟲(*Eimeria acervulina*)、腺樣艾美球蟲(*E. adenoides*)、阿拉巴艾美爾球蟲(*E. alabamensis*)、鴨艾美耳球蟲(*E. anatis*)、鵝艾美球蟲(*E. anseris*)、阿氏艾美球蟲(*E. arloingi*)、阿洛尼氏艾美球蟲(*E. ashata*)、奧本艾美球蟲(*E. auburnensis*)、牛艾美球蟲(*E. bovis*)、波氏艾美球蟲(*E. brunetti*)、犬艾美球蟲(*E. canis*)、栗鼠艾美球蟲(*E. chinchillae*)、鯡魚艾美球蟲(*E. clupearum*)、鴿艾美球蟲(*E. columbae*)、扭轉艾美球蟲(*E. contorta*)、槌狀艾美球蟲(*E. crandalis*)、狄氏艾美球蟲(*E. debliccki*)、分散艾美球蟲(*E. dispersa*)、橢圓艾美球蟲(*E. ellipsoidales*)、鐮形艾美球蟲(*E. falciiformis*)、福氏艾美球蟲(*E. faurei*)、黃色艾美球蟲(*E. flavescens*)、加洛帕沃尼艾美球蟲(*E. gallopavonis*)、哈氏艾美球蟲(*E. hagani*)、腸艾美球蟲(*E. intestinalis*)、易洛魁艾美球蟲(*E. iroquoina*)、伊氏艾美球蟲(*E. irresidua*)、拉本艾美球蟲(*E. labbeana*)、留氏艾美球蟲(*E. leucarti*)、大型艾美球蟲(*E. magna*)、巨型艾美球蟲(*E. maxima*)、中型艾美球蟲(*E. media*)、火雞艾美球蟲(*E. meleagridis*)、火雞和緩艾美球蟲(*E. meleagrimitis*)、和緩艾美球蟲(*E. mitis*)、毒害艾美球蟲(*E. necatrix*)、雅氏艾美球蟲(*E. ninakohlyakimovae*)、羊艾美球蟲(*E. ovis*)、小型艾美球蟲(*E. parva*)、孔雀艾美球蟲(*E. pavonis*)、穿孔艾美球蟲(*E. perforans*)、法森艾美球蟲(*E. phasani*)、梨形艾美球蟲(*E. piriformis*)、早熟艾美球蟲(*E. praecox*)、艾美球蟲(*E. residua*)、粗糙艾美球蟲(*E. scabra*)、艾美球蟲屬(*E. spec.*)、斯氏艾美球蟲(*E. stiedai*)、豬艾美球蟲(*E. suis*)、柔嫩艾美球蟲(*E. tenella*)、樹艾美球蟲(*E. truncata*)、特魯特艾美球蟲(*E. truttae*)、朱氏艾美球蟲(*E. zuernii*)、球蟲屬(*Globidium spec.*)、貝氏等孢球蟲(*Isospora belli*)、犬等孢球蟲(*I. canis*)、貓等孢球蟲(*I. felis*)、俄亥俄等孢球蟲(*I. ohioensis*)、芮氏等孢球蟲(*I. rivolta*)、等孢球蟲屬(*I. spec.*)、豬等孢球蟲(*I. suis*)、*Cystispora spec.*、隱孢子蟲屬(*Cryptosporidium spec.*)，特定言之小隱孢子蟲(*C. parvum*)；如：弓形蟲科(*Toxoplasmatidae*)，例如：鼠弓形蟲(*Toxoplasma gondii*)、哈芒球蟲(*Hammondia heydornii*)、犬新孢子蟲

(*Neospora caninum*)、貝內特貝斯諾孢子蟲(*Besnoitia besnoitii*)；如：肉孢子蟲科(*Sarcocystidae*)，例如：牛犬肉孢子蟲(*Sarcocystis bovicanis*)、牛人肉孢子蟲(*S. bovi hominis*)、羊犬肉孢子蟲(*S. ovicanis*)、羊貓肉孢子蟲(*S. ovifelis*)、神經肉孢子蟲(*S. neurona*)、肉孢子蟲屬(*S. spec.*)、豬人肉孢子蟲(*S. sui hominis*)；如：白細胞蟲科(*Leucozoidae*)，例如：西氏住白細胞蟲(*Leucozytozoon simondi*)；如：瘧原蟲科(*Plasmodiidae*)，例如：柏格氏鼠瘧原蟲(*Plasmodium berghei*)、惡性瘧原蟲(*P. falciparum*)、三日瘧原蟲(*P. malariae*)、卵形瘧原蟲(*P. ovale*)、間日瘧原蟲(*P. vivax*)、瘧蟲屬(*P. spec.*)；如：焦蟲目(*Piroplasma*)，例如：阿根廷巴貝蟲(*Babesia argentina*)、牛巴貝蟲(*B. bovis*)、犬巴貝蟲(*B. canis*)、巴貝蟲屬(*B. spec.*)、小泰勒蟲(*Theileria parva*)、泰勒蟲屬(*Theileria spec.*)；如：匿蟲亞目(*Adeleina*)，例如：犬肝簇蟲 (*Hepatozoon canis*)、肝簇蟲屬(*H. spec.*)

病原性體內寄生蟲為蠕蟲，包括：扁形動物門(*Platyhelmintha*) (例如：單殖吸蟲、條蟲及吸蟲)、線蟲、棘頭動物與舌形動物。其他蠕蟲包括：

單殖吸蟲亞綱(*Monogenea*)：例如：三代蟲屬(*Gyrodactylus spp.*)、指標蟲屬(*Dactylogyrus spp.*)、多盤吸蟲屬(*Polystoma spp.*)。

條蟲：擬葉目(*Pseudophyllidea*)，例如：廣節裂頭條蟲屬(*Diphyllobothrium spp.*)、螺旋體蟲屬(*Spirometra spp.*)、裂頭條蟲(*Schistocephalus spp.*)、舌狀條蟲屬(*Ligula spp.*)、吸葉條蟲屬(*Bothridium spp.*)、大複殖門條蟲屬(*Diphlogonoporus spp.*)

圓葉目(*Cyclophyllidea*)，例如：中殖孔屬條蟲屬(*Mesocestoides spp.*)、裸頭條蟲屬(*Anoplocephala spp.*)、副裸頭條蟲屬(*Paranoplocephala spp.*)、莫尼茨條蟲屬(*Moniezia spp.*)、隧體條蟲屬(*Thysanosoma spp.*)、曲子宮條蟲屬(*Thysaniezia spp.*)、無卵黃腺條蟲(*Avitellina spp.*)、史提拉條蟲屬(*Stilesia spp.*)、錫帶條蟲屬(*Cittotaenia spp.*)、安迪亞條蟲屬(*Andyra spp.*)、伯特條蟲屬(*Bertiella spp.*)、帶條蟲屬(*Taenia spp.*)、棘球條蟲屬(*Echinococcus spp.*)、泡尾條蟲屬(*Hydatigera spp.*)、戴文條蟲屬(*Davainea spp.*)、雷氏條蟲屬(*Raillietina spp.*)、包膜條蟲屬(*Hymenolepis spp.*)、瘍棘殼條蟲屬(*Echinolepis spp.*)、棘葉條蟲屬(*Echinocotyle spp.*)、迪克氏條蟲屬(*Diochis spp.*)、瓜實條蟲屬(*Dipylidium spp.*)、約優克斯條蟲屬(*Joyeuxiella spp.*)、雙孔條蟲屬(*Diplopylidium spp.*)

吸蟲：複殖綱(*Digenea*)，例如：複口吸蟲屬(*Diplostomum spp.*)、莖雙穴吸蟲

屬 (*Posthodiplostomum* spp.)、血吸蟲屬 (*Schistosoma* spp.)、毛畢屬 (*Trichobilharzia* spp.)、毛樣線蟲屬 (*Ornithobilharzia* spp.)、澳畢吸蟲屬 (*Austroilharzia* spp.)、巨畢吸蟲屬 (*Gigantobilharzia* spp.)、彩蚴吸蟲屬 (*Leucochloridium* spp.)、短咽吸蟲屬 (*Brachylaima* spp.)、棘口吸蟲屬 (*Echinostoma* spp.)、棘緣吸蟲屬 (*Echinoparyphium* spp.)、棘隙吸蟲屬 (*Echinochasmus* spp.)、低頸吸蟲屬 (*Hypoderaeum* spp.)、肝吸蟲屬 (*Fasciola* spp.)、擬片形吸蟲 (*Fasciolides* spp.)、薑片蟲屬 (*Fasciolopsis* spp.)、環腸吸蟲屬 (*Cyclocoelum* spp.)、盲腔屬 (*Typhlocoelum* spp.)、雙口吸蟲屬 (*Paramphistomum* spp.)、杯殖吸蟲屬 (*Calicophoron* spp.)、盤吸蟲屬 (*Cotylophoron* spp.)、巨盤吸蟲屬 (*Gigantocotyle* spp.)、菲策吸蟲屬 (*Fischoederius* spp.)、腹袋吸蟲屬 (*Gastrothylacus* spp.)、背孔吸蟲屬 (*Notocotylus* spp.)、下彎吸蟲屬 (*Catantropis* spp.)、斜睪吸蟲屬 (*Plagiorchis* spp.)、前殖吸蟲屬 (*Prosthogonimus* spp.)、雙腔吸蟲屬 (*Dicrocoelium* spp.)、闊盤吸蟲屬 (*Eurytrema* spp.)、鮭吸蟲屬 (*Troglorema* spp.)、並殖吸蟲屬 (*Paragonimus* spp.)、肛瘤吸蟲屬 (*Collyriclum* spp.)、隱孔吸蟲屬 (*Nanophyetus* spp.)、後睪吸蟲屬 (*Opisthorchis* spp.)、支睪吸蟲屬 (*Clonorchis* spp.)、次睪吸蟲屬 (*Metorchis* spp.)、異形吸蟲屬 (*Heterophyes* spp.)、後殖吸蟲屬 (*Metagonimus* spp.)

線蟲：毛形亞目 (*Trichinellida*)，例如：毛首線蟲屬 (*Trichuris* spp.)、毛細線蟲屬 (*Capillaria* spp.)、線蟲屬 (*Trichomosoides* spp.)、旋毛蟲屬 (*Trichinella* spp.)。墊刃目 (*Tylenchida*)，例如：細頸線蟲屬 (*Micronema* spp.)、糞桿線蟲屬 (*Strongyloides* spp.)

小桿亞目 (*Rhabditina*)，例如：圓線蟲屬 (*Strongylus* spp.)、三齒線蟲屬 (*Triodontophorus* spp.)、食道齒線蟲屬 (*Oesophagodontus* spp.)、毛線線蟲屬 (*Trichonema* spp.)、輻首線蟲屬 (*Gyalocephalus* spp.)、柱咽線蟲屬 (*Cylindropharynx* spp.)、盆口線蟲屬 (*Poteriostomum* spp.)、線蟲屬 (*Cyclococercus* spp.)、杯冠線蟲屬 (*Cylicostephanus* spp.)、食道口線蟲屬 (*Oesophagostomum* spp.)、夏柏線蟲屬 (*Chabertia* spp.)、冠尾線蟲屬 (*Stephanurus* spp.)、鉤蟲屬 (*Ancylostoma* spp.)、彎口線蟲屬 (*Uncinaria* spp.)、仰口線蟲屬 (*Bunostomum* spp.)、球首線蟲屬 (*Globocephalus* spp.)、比翼線蟲屬 (*Syngamus* spp.)、節蟲屬 (*Cyathostoma* spp.)、後圓線蟲屬 (*Metastrongylus* spp.)、網尾線蟲屬 (*Dictyocaulus*

spp.)、繆勒線蟲屬(*Muellerius* spp.)、原圓線蟲屬(*Protostrongylus* spp.)、新圓線蟲屬(*Neostromylus* spp.)、囊尾線蟲屬(*Cystocaulus* spp.)、肺圓線蟲屬(*Pneumostromylus* spp.)、指尾線蟲屬(*Spicocaulus* spp.)、鹿圓線蟲屬(*Elaphostromylus* spp.)、副麂圓線蟲屬(*Parelaphostromylus* spp.)、環體線蟲屬(*Crenosoma* spp.)、副環體線蟲屬(*Paracrenosoma* spp.)、住血線蟲屬(*Angiostrongylus* spp.)、肺線蟲屬(*Aelurostrongylus* spp.)、類絲線蟲屬(*Filaroides* spp.)、副類絲線蟲屬(*Parafilaroides* spp.)、毛圓線蟲屬(*Trichostrongylus* spp.)、血線蟲屬(*Haemonchus* spp.)、奧斯特線蟲屬(*Ostertagia* spp.)、馬歇爾線蟲屬(*Marshallagia* spp.)、古柏線蟲屬(*Cooperia* spp.)、細頸線蟲(*Nematodirus* spp.)、胃圓線蟲屬(*Hyostrongylus* spp.)、尖頭胃線蟲屬(*Obeliscoides* spp.)、裂口線蟲屬(*Amidostomum* spp.)、壺肛線蟲屬(*Ollulanus* spp.)

旋尾目(*Spirurida*)，例如：尖尾線蟲屬(*Oxyuris* spp.)、蟯蟲屬(*Enterobius* spp.)、栓尾線蟲屬(*Passalurus* spp.)、管狀線蟲屬(*Syphacia* spp.)、無刺蟯蟲屬(*Aspicularis* spp.)、異刺線蟲屬(*Heterakis* spp.)；蛔蟲屬(*Ascaris* spp.)、弓蛔屬(*Toxascaris* spp.)、弓首線蟲屬(*Toxocara* spp.)、貝利蛔蟲屬(*Baylisascaris* spp.)、副蛔屬(*Parascaris* spp.)、海獸胃線蟲屬(*Anisakis* spp.)、禽蛔屬(*Ascaridia* spp.)；棘口線蟲屬(*Gnathostoma* spp.)、泡翼線蟲屬(*Physaloptera* spp.)、吸吮線蟲屬(*Thelazia* spp.)、筒線蟲屬(*Gongylonema* spp.)、馬胃線蟲屬(*Habronema* spp.)、副柔絲線蟲屬(*Parabronema* spp.)、德拉西線蟲屬(*Draschia* spp.)、龍線蟲屬(*Dracunculus* spp.)；冠絲蟲屬(*Stephanofilaria* spp.)、類絲蟲屬(*Parafilaria* spp.)、絲狀線蟲屬(*Setaria* spp.)、羅阿絲蟲屬(*Loa* spp.)、血直絲蟲屬(*Dirofilaria* spp.)、光絲蟲屬(*Litomosoides* spp.)、血絲蟲屬(*Brugia* spp.)、吳策絲蟲屬(*Wuchereria* spp.)、蟠尾絲蟲屬(*Onchocerca* spp.)

棘頭動物門(*Acantocephala*)：少棘目(*Oligacanthorhynchida*)，例如：巨吻棘頭蟲屬(*Macracanthorhynchus* spp.)、前峯棘頭蟲屬(*Prosthenorchis* spp.)；多形目(*Polymorphida*)，例如：細頸棘頭蟲屬(*Filicollis* spp.)；念珠目(*Moniliformida*)，例如：聯珠狀棘頭蟲屬(*Moniliformis* spp.)

棘吻目(*Echinorhynchida*)，例如：棘頭蟲屬(*Acanthocephalus* spp.)、魚棘頭蟲屬(*Echinorhynchus* spp.)、似細吻棘頭蟲屬(*Leptorhynchoides* spp.)

舌形動物門(*Pentastoma*)：孔頭蟲目(*Porocephalida*)，例如：舌形蟲屬(*Linguatula*

spp.)

在獸醫與動物飼養領域中，式(I)化合物係呈合適之製劑型式，採用相關技藝上已知方法投藥，如：經腸、非經腸式、經皮膚或經鼻投藥。該投藥法可為預防性或醫療性。

因此，本發明一項具體實施例係指以式(I)化合物作為醫藥之用途。

另一態樣係指一種以式(I)化合物作為抗體內寄生蟲劑，特定言之殺蠕蟲劑或抗原蟲劑之用途。式(I)化合物適合在例如：動物畜養、動物養殖、動物圈養及衛生領域中作為抗體內寄生蟲劑，特定言之殺蠕蟲劑或抗原蟲劑使用。

另一態樣係有關一種以式(I)化合物作為抗體外寄生蟲劑，特定言之殺節肢動物劑，如：殺昆蟲劑或殺蜚蠊劑之用途。另一態樣係指一種以式(I)化合物在例如：動物畜養、動物養殖、動物圈養及衛生領域中作為抗體外寄生蟲劑，尤指殺節肢動物劑，如：殺昆蟲劑或殺蜚蠊劑之用途。

病媒控制

【0102】 本發明亦包括以式(I)化合物或包含式(I)化合物之殺昆蟲組成物於控制病媒(換言之，可使用根本發明式(I)化合物控制蚊、蝨、跳蚤、蠅、蟻、與蜚)上之用途。

【0103】 本發明之目的中，病媒係節肢動物，特定言之，會從帶原者(植物、動物、人類，等等)傳播病原菌(如，例如：病毒、蠕蟲、單細胞生物與細菌)給宿主之昆蟲或蜘蛛類。該病原菌可經由機械式傳播至宿主(例如：經由非叮咬性蠅傳播之沙眼)或經由注入傳播至宿主(例如：由蚊子傳播之瘧疾寄生蟲)。

病媒及其所傳播之疾病或病原菌之實例為：

1)蚊子

- 按蚊(*Anopheles*)：瘧疾、絲蟲病；
- 庫蚊(*Culex*)：日本腦炎、絲蟲病、其他病毒疾病、蠕蟲之傳播；
- 伊蚊(*Aedes*)：黃熱病、登格熱、絲蟲病、其他病毒疾病；
- 蚋科(*Simuliidae*)：傳播蠕蟲，特定言之，盤尾線蟲(*Onchocerca volvulus*)

2)蝨：皮膚傳染病、流行性斑疹傷寒；

3)跳蚤：疫病、鼠型斑疹傷寒；

4) 蠅：昏睡病(錐蟲病)；霍亂、其他細菌性疾病；

5) 蟎：家畜疥癬病、流行性斑疹傷寒、立克次痘疹(Rickettsialpox)、兔熱病(Tularamia)、聖路易腦炎(Saint-Louis encephalitis)、蜱傳播性腦炎(TBE)、克里米亞-剛果惡性血液疾病(Krim-Kongo haematologic fever)、流行性斑疹傷寒、疏螺旋體病；

6) 蜱：疏螺旋體病(Borelliosis)，如：杜通氏螺旋體(*Borrelia duttoni*)、蜱傳播性腦炎、Q 熱(貝氏考克斯菌(*Coxiella burnetii*))、焦蟲症(犬焦蟲症(*Babesia canis canis*))。

【0104】 本發明之病媒實例為昆蟲，例如：會傳播植物病毒給植物之蚜蟲、蠅、葉蟬或薊馬。其他會傳播植物病毒之病媒為蜘蛛蟎、蝨、甲蟲與線蟲。

【0105】 本發明病媒之其他實例為昆蟲與蜘蛛類，如：蚊子，特定言之可能傳播病原菌給動物與/或人類之伊蚊(*Aedes*)、按蚊(*Anopheles*)，例如：甘比亞按蚊(*A. gambiae*)、阿拉伯按蚊(*A. arabiensis*)、致死按蚊(*A. funestus*)、大劣按蚊(*A. dirus*)(瘧疾)與庫蚊(*Culex*)、蝨、跳蚤、蠅、蟎、與蜱。

【0106】 亦可能使用突破抗性之式(I)化合物控制病媒。

【0107】 式(I)化合物適用於預防由病媒傳播之疾病或病原菌。因此本發明另一態樣係以式(I)化合物於控制病媒之用途，例如：用於農業、園藝、花園與休閒活動設施，及亦用於保護原料與庫存產品。

保護工業原料

【0108】 式(I)化合物適用於保護原料，對抗昆蟲之侵害或破壞，例如：鞘翅目(Coleoptera)、膜翅目(Hymenoptera)、等翅目(Isoptera)、鱗翅目(Lepidoptera)、嚙蟲目(Psocoptera)與總尾目(Zygentoma)。

【0109】 咸了解，本文所指之工業材料為無生命材料，如：較佳為塑膠、膠黏劑、膠水、紙張與紙板、皮革、木料、加工木製品與塗料組成物。本發明用途特別適合保護木料。

【0110】 另一項具體實施例中，式(I)化合物係與至少一種其他殺昆蟲劑與/或至少一種殺真菌劑使用。

【0111】 另一項具體實施例中，式(I)化合物係呈即用型殺蟲劑，亦即其不需要進一步修飾即可施用在所需材料上。合適之其他殺昆蟲劑或殺真菌劑特定言之係如上述說明者。

【0112】 亦已驚人地發現，式(I)化合物可用於保護與鹽水或鹹水接觸之物品，特定言之船體、隔板、編網、建築物、繫船設備及訊號系統，防止污塞。同樣地，式(I)化合物可單獨使用或與其他活性化合物組合，作為抗污塞劑使用。

於衛生領域中控制動物害蟲

【0113】 式(I)化合物適合在衛生領域中控制動物害蟲。特定言之，本發明可應用在居家領域、衛生領域及保護庫存產品中控制動物害蟲，尤指控制昆蟲、蜘蛛與蟎類等常出現在封閉空間之動物害蟲，例如：住家、廠房、辦公室、車廂。式(I)化合物可單獨使用或與其他活性化合物與/或輔劑組合用於控制動物害蟲。該等其他化合物較佳係家庭用殺昆蟲劑產品。式(I)化合物可有效對抗敏感性及抗性品種，並對抗所有發展階段。

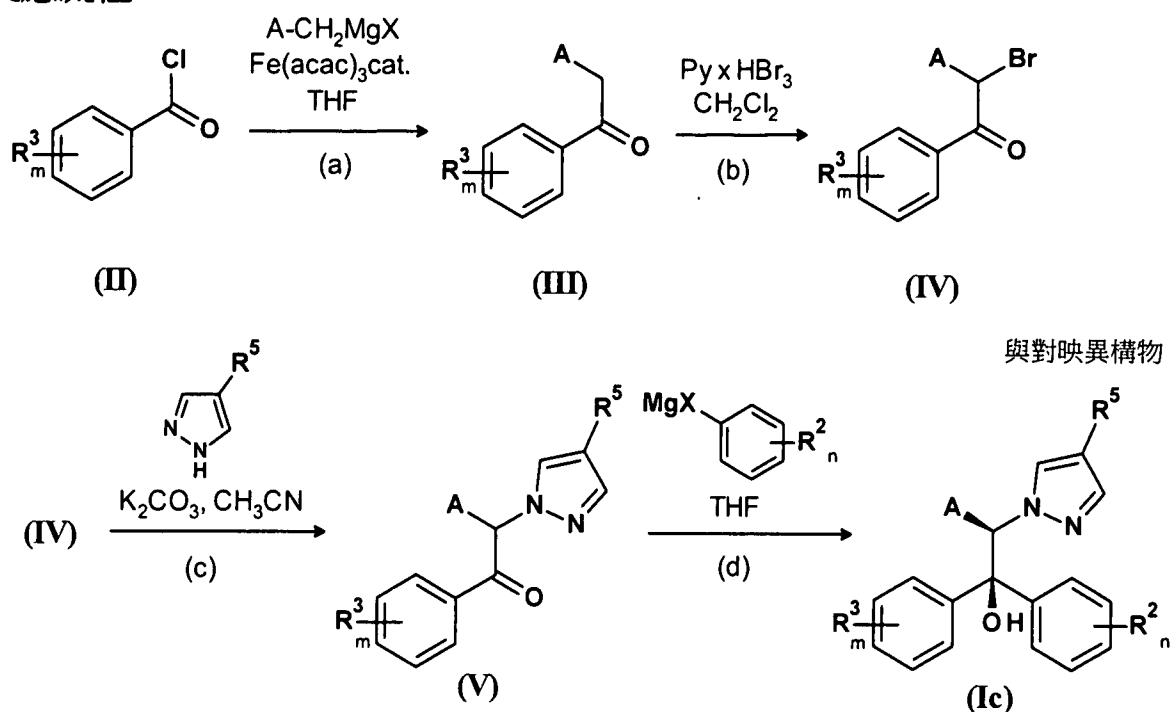
【0114】 此等害蟲包括例如：蜘蛛綱(Arachnida)，蠍目(Scorpiones)、蜘蛛目(Araneae)與盲蛛目(Opiliones)；唇足目(Chilopoda)與重足目(Diplopoda)；昆蟲綱，蜚蠊目(Blattodea)、鞘翅目(Coleoptera)、革翅目(Dermoptera)、雙翅目(Diptera)、異翅目(Heteroptera)、膜翅目(Hymenoptera)、等翅目(Isoptera)、鱗翅目(Lepidoptera)、毛蟲目(Phthiraptera)、嚙蟲目(Psocoptera)、跳躍亞目(Saltatoria)或直翅目(Orthoptera)、蚤目(Siphonaptera)與總尾目(Zygentoma)，及軟甲綱(Malacostraca)等足目(Isopoda)。

【0115】 其可呈例如：氣霧劑、無壓力噴灑產品，例如：泵壓及霧化噴灑器、自動噴霧系統、霧化器、發泡物、凝膠、使用由纖維素或塑膠製成之蒸發片之蒸發器產品、液體蒸發器、凝膠及膜式蒸發器、螺漿驅動式蒸發器、無能源或被動式蒸發系統、防蟲紙、防蟲袋及防蟲膠，呈粒狀或細粉，用於撒播式誘餌或用於誘餌台等形式使用。

合成流程

【0116】 式(IIb)中 R^2 、 R^3 、 R^5 、 n 與 m 如前述定義且 A 代表(C₁-C₄)烷基之化合物可依反應流程 A 所示之方法製備：

反應流程 A



【0117】 反應流程 A 步驟(a)為鐵催化芳醯基氯(II)與格林納(Grignard)型試劑之交聯反應(B. Scheiper, M. Bonnekessel、H. Krause 與 A. Fürstner 之 *J. Org. Chem.* **2004**, *69*, 3943–3949)。

【0118】 反應流程 A 步驟(b)為芳基烷基酮(III)之 α -溴化反應。可採用吡啶鎬三溴化物於二氯甲烷中與酮進行溫和之 α -溴化反應(C. Djerassi, C. R. Scholz, *J. Am. Chem. Soc.* **1948**, *70*, 417–418)。其他可能之試劑系統包括例如：*N*-溴琥珀醯亞胺或溴，於乙酸中反應。

【0119】 反應流程 A 之步驟(c)中，由 α -溴烷基芳基酮(IV)與吡唑反應，產生 α -吡唑基烷基芳基酮(V)。

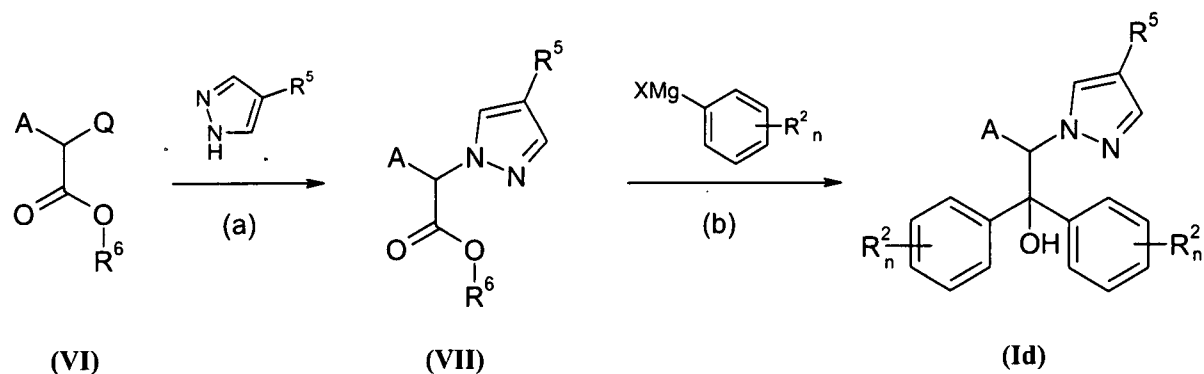
【0120】 反應流程 A 之步驟(d)為 α -吡唑基烷基芳基酮(V)在 α -碳上誘發不對稱性之格林納芳基化反應，其主要造成(Ic)之其中一種可能之非對映異構物(例如：超過 70 : 30、80 : 20 或甚至 90 : 10)。該立體選擇性可能歸因於反應

物(V)與產物(Ic)二者中之鎂陽離子會與吡唑基部份基團之氮及羰基態氧形成複合物，迫使形成特定之非對映異構物(B. N. Hitesh Kumar, V. Murugesan, T. Prakasam, P. S. Srinivasan, D. V. Ramana, *Tetrahedron, Asymmetry* **2009**, *20*, 2773–2779)。以實例 I-2 之 X-射線分析法證實(Ic)之相對立體化學(參見圖 1)。

【0121】 芳基鎂化合物可自商品取得或可以採用例如：LiCl-媒介之 Br/Mg 交換法，使用異丙基鎂化氯-氯化鋰複合物製備(A. Krasovskiy, P. Knochel, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2004**, *43*, 3333–3336)。

【0122】 式(Id)中 R^2 與 R^3 、 n 與 m 相同，且 R^2 與 n 、 R^5 如前述定義，及 A 為(C₁-C₄)烷基，較佳為甲基之化合物亦可採用反應流程 B 所示之方法製備，其中 R^6 為(C₁-C₄)烷基，及 Q 為脫離基，較佳為氯或溴，其過去已說明於 EP 0 158 448、EP 0 194 064、與 WO 1986/002072：

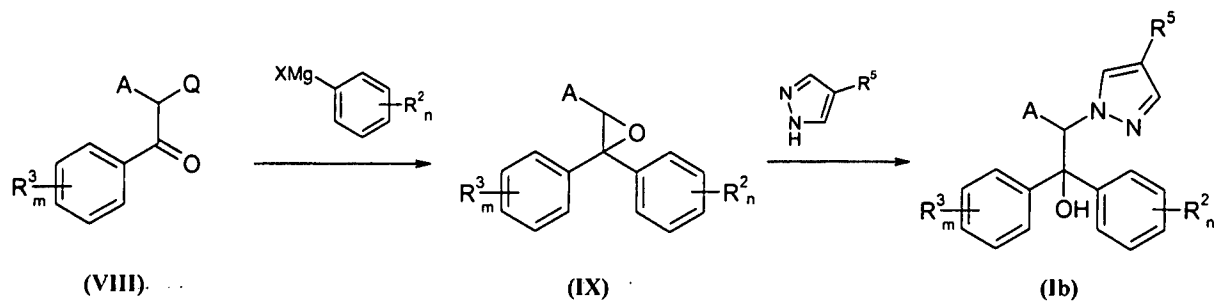
反應流程 B



【0123】 由 α -鹵丙酸酯(VI)與吡唑反應，產生相應之 α -(1H-吡唑-1-基)丙酸酯(VII)。後者再與 2 當量芳基格林納試劑反應，產生相應之 1,1-對稱性二取代之 2-(1H-吡唑-1-基)丙醇(Id)。

【0124】 式(Ib)中 Q、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 m 與 n 如前述定義，及 A 為(C₁-C₄)烷基，較佳為甲基之化合物亦可依反應流程 C 所示製備，其過去已說明於 EP 0 158 448 與 WO 1986/002072：

反應流程 C

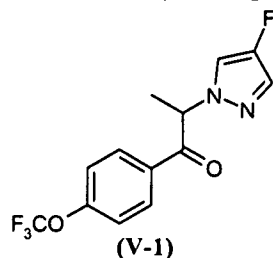


【0125】 由 α -鹵代丙醯苯(VIII)與芳基格林納物質反應，產生環氧乙烷(IX)，其再與吡啶反應，產生相應之 1,1-二取代之 2-(1H-吡啶-1-基)丙醇(Ib)。

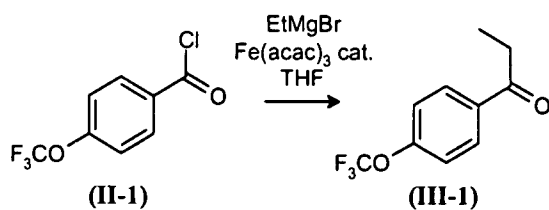
實例

關鍵中間物

2-(4-氟-1H-吡啶-1-基)-1-[4-(三氟甲氧基)苯基]丙烷-1-酮 (V-1)製法

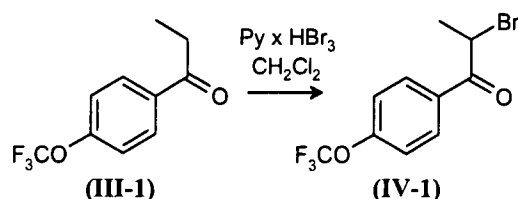


步驟 1



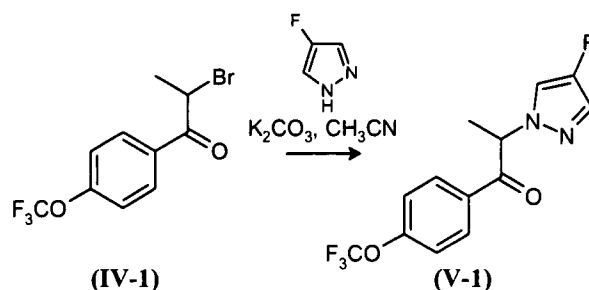
【0126】 取乙基鎂化氯(2 M THF 溶液，9.38 mL, 18.77 mmol)以 50 min 時間加至 -20°C 與氬氣下之 4-(三氟甲氧基)苯甲醯基氯(II-1)(純度 98%, 5.00 g, 21.82 mmol)與乙醯基丙酮酸鐵(III)(385 mg, 1.09 mmol)之 THF(70 mL)溶液中。於該溫度下攪拌 10 min 後，反應混合物使用 1 N HCl 中止反應，混合物使用 CH_2Cl_2 重覆萃取。合併之有機層使用 2 N NaOH 洗滌，經 Na_2SO_4 脫水與蒸發，產生 1-[4-(三氟甲氧基)苯基]丙烷-1-酮 (III-1) (純度 90%, 4.95 g, 93%)。 ^1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 1.09 (t, 3H), 3.07 (q, 2H), 7.50 (d, 2H), 8.10 (d, 2H)。

步驟 2



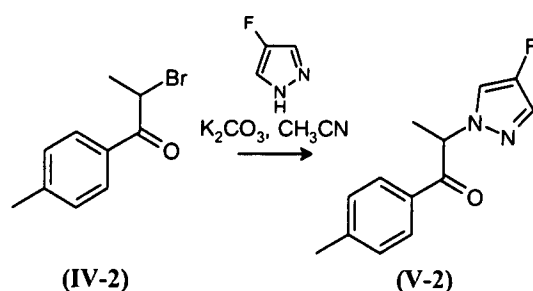
【0127】 在含 1-[4-(三氟甲氧基)苯基]丙烷-1-酮 (III-1) (純度 80%, 15.87 g, 58.19 mmol) 之二氯甲烷(200 mL)溶液中分批添加吡啶鎊三溴化物(純度 90%, 20.68 g, 58.19 mmol)。於室溫下攪拌一夜後，反應混合物使用 1 N HCl 中止反應。有機層使用飽和氯化鈉水溶液洗滌，經硫酸鈉脫水，過濾與減壓濃縮。殘質經矽石急驟層析法純化(環己烷/乙酸乙酯，99.5/0.5 至 97/3)，產生 2-溴-1-[4-(三氟甲氧基)苯基]丙烷-1-酮 (IV-1) (純度 98%, 11.19 g, 63%)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 1.91 (d, 3H), 5.23 (q, 1H), 7.31 (d, 2H), 8.09 (d, 2H)。

步驟 3



【0128】 在含 4-氟-1H-吡唑(純度 97.5%, 1.02 g, 11.55 mmol)之乙腈(30 mL)溶液中依序添加無水碳酸鉀(1.92 g, 13.86 mmol)與含 2-溴-1-[4-(三氟甲氧基)苯基]丙烷-1-酮 (IV-1) (純度 98%, 3.50 g, 11.55 mmol)之乙腈(10 mL)溶液。於室溫下攪拌一夜後，反應混合物倒至水中，使用乙酸乙酯重覆萃取。有機層使用水洗滌，經硫酸鈉脫水，過濾與減壓濃縮。殘質經矽石急驟層析法純化(環己烷/乙酸乙酯，100/0 至 87/13)，產生 2-(4-氟-1H-吡唑-1-基)-1-[4-(三氟甲氧基)苯基]丙烷-1-酮 (V-1) (2.76 g, 79%)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 1.61 (d, 3H), 6.19 (q, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.51 (d, 2H), 8.09 (m, 3H)。

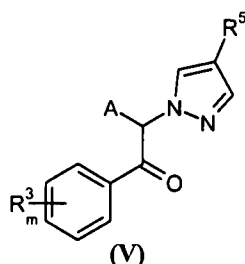
2-(4-氟-1H-吡唑-1-基)-1-(4-甲基苯基)丙烷-1-酮 (V-2)製法



【0129】 在含 2-溴-1-[4-甲基苯基]丙烷-1-酮 (IV-2) (自商品取得, 純度 90%, 1.60 g, 6.34 mmol) 之乙腈(45 mL)溶液中依序添加無水碳酸鉀(1.05 g, 7.61 mmol)與 4-氟-1H-吡唑 (546 mg, 6.34 mmol)。於室溫下攪拌一夜後, 反應混合物過濾與減壓濃縮。殘質經矽石急驟層析法純化(環己烷/乙酸乙酯, 98/2 至 70/30), 產生 2-(4-氟-1H-吡唑-1-基)-1-[4-甲基苯基]丙烷-1-酮 (V-2) (純度 98%, 1.37 g, 91%)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 1.60 (d, 3H), 2.37 (s, 3H), 6.14 (q, 1H), 7.33 (d, 2H), 7.44 (d, 1H), 7.87 (d, 2H), 8.06 (d, 1H)。

【0130】 下列化合物係採用類似上述合成中間物(V-1)或(V-2)之製程, 使用自商品取得或可採用彼等熟悉此相關技藝之人士習知之製法製備之適當起始物製備。

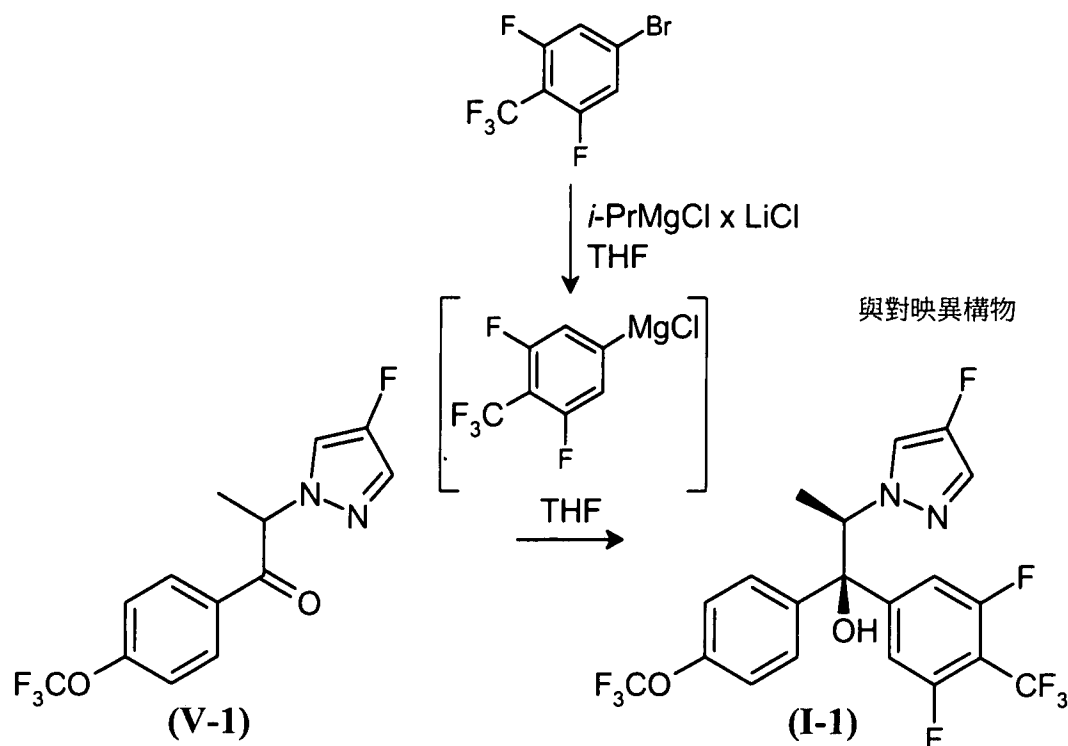
表 1



中間物編號	R ⁵	A	(R ³) _m	特徵
V-1	F	CH ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.61 (d, 3H), 6.19 (q, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.51 (d, 2H), 8.09 (m, 3H).
V-2	F	CH ₃	4-CH ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.60 (d, 3H), 2.37 (s, 3H), 6.14 (q, 1H), 7.33 (d, 2H), 7.44 (d, 1H), 7.87 (d, 2H), 8.06 (d, 1H).
V-3	Cl	CH ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 1.75 (d, 3H), 5.96 (q, 1H), 7.29 (d, 2H), 7.44 (s, 1H), 7.54 (s, 1H), 8.04 (d, 2H).
V-4	Br	CH ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 1.76 (d, 3H), 5.99 (q, 1H), 7.29 (d, 2H), 7.48 (s, 1H), 7.57 (s, 1H), 8.04 (d, 2H).
V-5	CN	CH ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 1.81 (d, 3H), 6.13 (q, 1H), 7.34 (d, 2H), 7.81 (s, 1H), 8.04 (s, 1H), 8.05 (d, 2H).

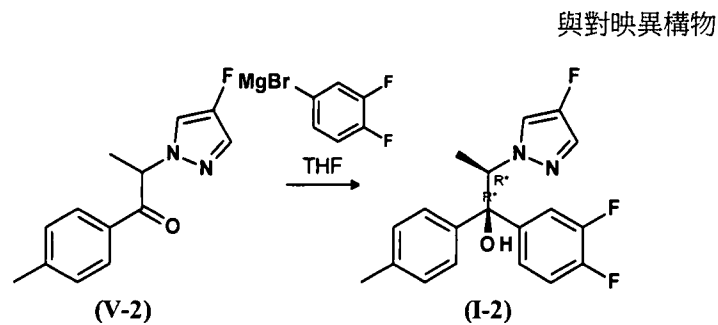
中間物編號	R ⁵	A	(R ³) _m	特徴
V-6	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 1.73 (d, 3H), 2.05 (s, 3H), 5.92 (q, 1H), 7.26 (m, 3H), 7.33 (s, 1H), 8.03 (d, 2H).
V-7	OCH ₃	CH ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 1.72 (d, 3H), 3.72 (s, 3H), 5.86 (q, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.26 (m, 3H), 8.02 (d, 2H).
V-8	F	CH ₃	4-CF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.62 (d, 3H), 6.23 (q, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.89 (d, 2H), 8.11 (m, 3H).
V-9	F	CH ₃	3-F	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.61 (d, 3H), 6.18 (q, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.51 (m, 1H), 7.58 (m, 1H), 7.74 (m, 1H), 7.80 (m, 1H), 8.09 (d, 1H).
V-10	F	CH ₃	4-F	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.61 (d, 3H), 6.18 (q, 1H), 7.36 (t, 2H), 7.46 (d, 1H), 8.05 (m, 3H).
V-11	F	CH ₃	3,4-F ₂	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.61 (d, 3H), 6.18 (q, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.61 (m, 1H), 7.86 (m, 1H), 8.02 (m, 1H), 8.09 (d, 1H).
V-12	F	CH ₃	3,4,5-F ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.61 (d, 3H), 6.19 (q, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.92 (dd, 2H), 8.10 (d, 1H).
V-13	F	CH ₃	3-F, 4-CF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.61 (d, 3H), 6.21 (q, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.96 (t, 1H), 8.00 (d, 1H), 8.11 (d, 1H).
V-14	Cl	CH ₃	4-CH ₃	¹ H NMR (400 MHz, CD ₃ CN) δ 1.67 (d, 3H), 2.39 (d, 3H), 6.03 (q, 1H), 7.32 (d, 2H), 7.40 (s, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.84 (d, 2H).
V-15	NO ₂	CH ₃	4-CH ₃	¹ H NMR (400 MHz, CD ₃ CN) δ 1.76 (d, 3H), 2.43 (d, 3H), 6.17 (q, 1H), 7.36 (d, 2H), 7.90 (d, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.58 (s, 1H).
V-16	F	CH ₃	4-I	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.59 (d, 3H), 6.13 (q, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.70 (d, 2H), 7.90 (d, 2H), 8.06 (d, 1H).
V-17	F	CH ₃	4-SCH ₃	¹ H NMR (400 MHz, CD ₃ CN) δ 1.65 (d, 3H), 2.52 (s, 3H), 5.93 (q, 1H), 7.32 (m, 3H), 7.65 (d, 1H), 7.85 (d, 2H).
V-18	F	CH ₃	4-SCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CD ₃ CN) δ 1.66 (d, 3H), 5.95 (q, 1H), 7.33 (m, 3H), 7.68 (d, 1H), 7.77 (d, 2H), 7.96 (d, 2H).

實例

rel-(1R,2R)-1-[3,5-二氟-4-(三氟甲基)苯基]-2-(4-氟-1H-吡唑-1-基)-1-[4-(三氟甲氧基)苯基]丙烷-1-醇(I-1)製法

【0131】 添加異丙基鎂化氯-氯化鋰複合物之溶液(1.3 M THF 溶液, 0.59 mL, 0.76 mmol)至 0°C 與氬氣下之 5-溴-1,3-二氟-2-(三氟甲基)苯(純度 97%, 197 mg, 0.73 mmol)中。於該溫度下攪拌 30 min 後, 添加含 2-(4-氟-1H-吡唑-1-基)-1-[4-(三氟甲氧基)苯基]丙烷-1-酮 (V-1) (純度 99%, 80 mg, 0.26 mmol)之 1 mL THF 溶液。於室溫下攪拌 40 min 後, 反應混合物使用 10% HCl 水溶液中止反應, 經 Na₂SO₄ 脫水, 過濾與減壓濃縮。殘質經矽石急驟層析法純化(環己烷/丙酮, 97/3 至 92/8), 產生 *rel*-(1R,2R)-1-[3,5-二氟-4-(三氟甲基)苯基]-2-(4-氟-1H-吡唑-1-基)-1-[4-(三氟甲氧基)苯基]丙烷-1-醇(I-1) (純度 97%, 82 mg, 62%)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 1.35 (d, 3H), 5.76 (q, 1H), 6.68 (s, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.42 (m, 4H), 7.83 (m, 3H)。

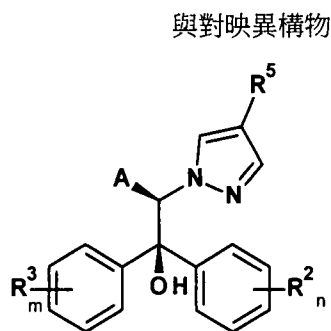
rel-(1R,2R)-1-(3,4-二氟苯基)-2-(4-氟-1H-吡唑-1-基)-1-[4-甲基苯基]丙烷-1-醇(I-2)製法



【0132】 在含 2-(4-氟-1H-吡唑-1-基)-1-[4-甲基苯基]丙烷-1-酮 (V-2) (83 mg, 0.36 mmol)之 THF (5 mL)溶液中添加 3,4-二氟苯基鎂化溴之溶液(0.5 M THF 溶液, 0.93 mL, 0.47 mmol)。於室溫下攪拌 2 h 後, 反應混合物使用 1 N HCl 中止反應, 經 Na₂SO₄ 脫水, 過濾與減壓濃縮。殘質經矽石急驟層析法純化(環己烷/丙酮, 100/0 至 0/100), 產生 *rel*-(1*R*,2*R*)-1-(3,4-二氟苯基)-2-(4-氟-1H-吡唑-1-基)-1-[4-甲基苯基]丙烷-1-醇(I-2) (純度 97%, 82 mg, 64%)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 1.32 (d, 3H), 2.27 (s, 3H), 5.59 (q, 1H), 6.17 (s, 1H), 7.15-7.25 (m, 2H), 7.17 (d, 2H), 7.30 (d, 1H), 7.38 (m, 1H), 7.51 (d, 2H), 7.79 (d, 1H)。

【0133】 下列化合物係採用彼等類似上述合成實例(I-1)或(I-2)之製程, 使用自商品取得或可採用彼等熟悉此相關技藝之人士習知之製法製備之適當起始物製備。

表 2



實例編號	R ⁵	A	(R ³) _m	(R ²) _n	特徵
I-1	F	CH ₃	4-OCF ₃	3-F, 5-F, 4-CF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.35 (d, 3H), 5.76 (q, 1H), 6.68 (s, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.42 (m, 4H), 7.83 (m, 3H).

實例編號	R ⁵	A	(R ³) _m	(R ²) _n	特徵
I-2	F	CH ₃	4-CH ₃	3-F, 4-F	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.32 (d, 3H), 2.27 (s, 3H), 5.59 (q, 1H), 6.17 (s, 1H), 7.20 (m, 2H), 7.17 (d, 2H), 7.30 (d, 1H), 7.38 (m, 1H), 7.51 (d, 2H), 7.79 (d, 1H).
I-3	Cl	CH ₃	4-OCF ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 1.46 (d, 3H), 5.12 (q, 1H), 6.00 (s, 1H), 7.03 (d, 2H), 7.19 (d, 2H), 7.30 (s, 1H), 7.31 (s, 1H), 7.40 (d, 2H), 7.59 (d, 2H).
I-4	Br	CH ₃	4-OCF ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 1.46 (d, 3H), 5.15 (q, 1H), 6.00 (s, 1H), 7.03 (d, 2H), 7.19 (d, 2H), 7.32 (s, 1H), 7.35 (s, 1H), 7.40 (d, 2H), 7.59 (d, 2H).
I-5	CN	CH ₃	4-OCF ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 1.51 (d, 3H), 5.28 (q, 1H), 5.51 (s, 1H), 7.04 (d, 2H), 7.21 (d, 2H), 7.39 (d, 2H), 7.60 (d, 2H), 7.69 (s, 1H), 7.77 (s, 1H).
I-6	F	CH ₃	4-OCF ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 1.46 (d, 3H), 5.05 (q, 1H), 6.04 (s, 1H), 7.03 (d, 2H), 7.20 (m, 4H), 7.41 (d, 2H), 7.59 (d, 2H).
I-7	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 1.44 (d, 3H), 1.92 (s, 3H), 5.09 (q, 1H), 6.58 (s, 1H), 7.00 (m, 3H), 7.18 (m, 3H), 7.40 (d, 2H), 7.60 (d, 2H).
I-8	OCH ₃	CH ₃	4-OCF ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 1.44 (d, 3H), 3.61 (s, 3H), 5.02 (q, 1H), 6.31 (s, 1H), 6.94 (s, 1H), 7.02 (d, 2H), 7.12 (s, 1H), 7.19 (d, 2H), 7.41 (d, 2H), 7.59 (d, 2H).
I-9	F	CH ₃	4-OCF ₃	Cl	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.31 (d, 3H), 5.67 (q, 1H), 6.29 (s, 1H), 7.21 (d, 2H), 7.31 (d, 1H), 7.36 (d, 2H), 7.46 (d, 2H), 7.75 (d, 2H), 7.79 (d, 1H).
I-10	F	CH ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.48 (d, 3H), 5.71 (q, 1H), 6.57 (s, 1H), 7.05 (m, 2H), 7.13 (d, 1H), 7.36 (d, 2H), 7.68 (m, 3H), 7.77 (d, 1H).
I-11	F	CH ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-CF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.51 (d, 3H), 5.77 (q, 1H), 6.68 (s, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.38 (m, 4H), 7.69 (d, 2H), 7.80 (m, 2H).
I-12	F	CH ₃	4-OCF ₃	3-CH ₃ , 4-CF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.30 (d, 3H), 2.15 (s, 3H), 5.67 (q, 1H), 6.26 (s, 1H), 7.09 (m, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.38 (m, 3H), 7.45 (d, 1H), 7.77 (d, 2H), 7.79 (d, 1H).

實例編號	R ⁵	A	(R ³) _m	(R ²) _n	特徵
I-13	F	CH ₃	4-OCF ₃	4-CH ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.28 (d, 3H), 2.15 (s, 3H), 5.66 (q, 1H), 6.10 (s, 1H), 6.96 (d, 2H), 7.34 (m, 5H), 7.72 (d, 2H), 7.80 (d, 1H).
I-14	F	CH ₃	4-OCF ₃	3-F, 4-F	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.32 (d, 3H), 5.67 (q, 1H), 6.38 (s, 1H), 7.23 (m, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.37 (d, 2H), 7.45 (m, 1H), 7.78 (m, 3H).
I-15	F	CH ₃	4-OCF ₃	3-F, 4-F, 5-F	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.32 (d, 3H), 5.69 (q, 1H), 6.51 (s, 1H), 7.36 (m, 5H), 7.80 (m, 3H).
I-16	F	CH ₃	4-OCF ₃	H	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.31 (d, 3H), 5.69 (q, 1H), 6.16 (s, 1H), 7.06 (m, 1H), 7.16 (t, 2H), 7.30 (d, 1H), 7.33 (d, 2H), 7.47 (d, 2H), 7.75 (d, 2H), 7.79 (d, 1H).
I-17	F	CH ₃	4-OCF ₃	3-(OCF ₃), 4-(OCF ₃)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.36 (d, 3H), 5.67 (q, 1H), 6.54 (s, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.40 (d, 2H), 7.46 (m, 2H), 7.55 (s, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.81 (d, 2H).
I-18	F	CH ₃	4-OCF ₃	3,4 -OCF ₂ O-	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.32 (d, 3H), 5.69 (q, 1H), 6.38 (s, 1H), 7.19 (d, 1H), 7.30 (m, 2H), 7.37 (d, 2H), 7.46 (m, 1H), 7.78 (d, 2H), 7.79 (d, 1H).
I-19	F	CH ₃	4-OCF ₃	3-CF ₃ , 4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.37 (d, 3H), 5.67 (q, 1H), 6.61 (s, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.41 (d, 2H), 7.46 (m, 1H), 7.73 (m, 2H), 7.78 (d, 1H), 7.82 (d, 2H).
I-20	F	CH ₃	4-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.26 (d, 3H), 2.09 (s, 3H), 5.57 (q, 1H), 6.41 (s, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.05 (d, 1H), 7.34 (m, 3H), 7.50 (d, 2H), 7.81 (d, 1H), 7.90 (d, 1H).
I-21	F	CH ₃	4-OCF ₃	4-CF(CF ₃) ₂	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.35 (d, 3H), 5.68 (q, 1H), 6.38 (s, 1H), 7.23 (d, 1H), 7.39 (d, 2H), 7.45 (d, 2H), 7.66 (d, 2H), 7.72 (d, 1H), 7.80 (d, 2H).
I-22	F	CH ₃	4-OCF ₃	4-OCHF ₂	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.30 (d, 3H), 5.68 (q, 1H), 6.25 (s, 1H), 6.96 (d, 2H), 7.12 (t, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.37 (d, 2H), 7.50 (d, 2H), 7.75 (d, 2H), 7.80 (d, 1H).
I-23	F	CH ₃	4-OCF ₃	3-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.33 (d, 3H), 5.69 (q, 1H), 6.37 (s, 1H), 7.07 (m, 1H), 7.27 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.38 (m, 3H), 7.43 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.79 (d, 2H).

實例編號	R ⁵	A	(R ³) _m	(R ²) _n	特徵
I-24	F	CH ₃	4-OCF ₃	4-CF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.34 (d, 3H), 5.75 (q, 1H), 6.42 (s, 1H), 7.28 (d, 1H), 7.37 (d, 2H), 7.53 (d, 2H), 7.67 (d, 2H), 7.79 (m, 3H).
I-25	F	CH ₃	4-OCF ₃	4-SCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.33 (d, 3H), 5.71 (q, 1H), 6.38 (s, 1H), 7.27 (d, 1H), 7.37 (d, 2H), 7.50 (d, 2H), 7.60 (d, 2H), 7.78 (m, 3H).
I-26	F	CH ₃	4-OCF ₃	4-CF ₂ CHF ₂	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.32 (d, 3H), 5.67 (q, 1H), 6.29 (s, 1H), 6.73 (tm, 1H), 7.05 (d, 2H), 7.29 (d, 1H), 7.37 (d, 2H), 7.51 (d, 2H), 7.78 (m, 3H).
I-27	F	CH ₃	4-OCF ₃	4-CF ₂ Ph	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.32 (d, 3H), 5.69 (q, 1H), 6.29 (s, 1H), 7.30 (m, 3H), 7.35 (d, 2H), 7.43 (m, 5H), 7.56 (d, 2H), 7.77 (m, 3H).
I-28	F	CH ₃	4-CF ₃	H	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.31 (d, 3H), 5.75 (q, 1H), 6.23 (s, 1H), 7.07 (t, 1H), 7.17 (t, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.49 (d, 2H), 7.72 (d, 2H), 7.80 (d, 1H), 7.87 (d, 2H).
I-29	F	CH ₃	4-CF ₃	4-CH ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.28 (d, 3H), 2.15 (s, 3H), 5.72 (q, 1H), 6.17 (s, 1H), 6.97 (d, 2H), 7.33 (d, 1H), 7.37 (d, 2H), 7.70 (d, 2H), 7.82 (m, 3H).
I-30	F	CH ₃	4-CF ₃	4-Cl	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.31 (d, 3H), 5.73 (q, 1H), 6.36 (s, 1H), 7.22 (d, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.47 (d, 2H), 7.73 (d, 2H), 7.81 (d, 1H), 7.87 (d, 2H).
I-31	F	CH ₃	4-CF ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.32 (d, 3H), 5.74 (q, 1H), 6.40 (s, 1H), 7.16 (d, 2H), 7.30 (d, 1H), 7.57 (d, 2H), 7.74 (d, 2H), 7.80 (d, 1H), 7.88 (d, 2H).
I-32	F	CH ₃	4-CF ₃	3-F, 4-F	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.32 (d, 3H), 5.73 (q, 1H), 6.45 (s, 1H), 7.25 (m, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.48 (m, 1H), 7.75 (d, 2H), 7.81 (d, 1H), 7.89 (d, 2H).
I-33	F	CH ₃	4-CF ₃	3-F, 4-F, 5-F	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.32 (d, 3H), 5.75 (q, 1H), 6.58 (s, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.38 (m, 2H), 7.76 (d, 2H), 7.82 (d, 1H), 7.92 (d, 2H).
I-34	F	CH ₃	4-CF ₃	2-F, 4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.48 (d, 3H), 5.75 (q, 1H), 6.66 (s, 1H), 7.07 (m, 2H), 7.15 (d, 1H), 7.71 (m, 3H), 7.78 (m, 3H).

實例編號	R ⁵	A	(R ³) _m	(R ²) _n	特徴
I-35	F	CH ₃	4-CF ₃	3-F, 5-F, 4-CF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.35 (d, 3H), 5.82 (q, 1H), 6.75 (s, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.46 (d, 2H), 7.78 (d, 2H), 7.84 (d, 1H), 7.95 (d, 2H).
I-36	F	CH ₃	4-CF ₃	4-CF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.34 (d, 3H), 5.81 (q, 1H), 6.50 (s, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.53 (d, 2H), 7.69 (d, 2H), 7.75 (d, 2H), 7.82 (d, 1H), 7.90 (d, 2H).
I-37	F	CH ₃	4-CF ₃	4-SCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.31 (d, 3H), 5.76 (q, 1H), 6.45 (s, 1H), 7.28 (d, 1H), 7.51 (d, 2H), 7.62 (d, 2H), 7.75 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.90 (d, 2H).
I-38	F	CH ₃	4-CF ₃	3-F, 4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.33 (d, 3H), 5.75 (q, 1H), 6.54 (s, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.37 (m, 2H), 7.54 (m, 1H), 7.76 (d, 2H), 7.80 (d, 1H), 7.91 (d, 2H).
I-39	F	CH ₃	4-CF ₃	4-OCHF ₂	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.30 (d, 3H), 5.74 (q, 1H), 6.32 (s, 1H), 6.96 (d, 2H), 7.13 (t, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.74 (d, 2H), 7.82 (d, 1H), 7.87 (d, 2H).
I-40	F	CH ₃	3-F	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.32 (d, 3H), 5.69 (q, 1H), 6.30 (s, 1H), 7.08 (m, 1H), 7.14 (d, 2H), 7.29 (d, 1H), 7.45 (m, 3H), 7.57 (d, 2H), 7.77 (d, 1H).
I-41	F	CH ₃	3-F	4-Cl	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.31 (d, 3H), 5.67 (q, 1H), 6.26 (s, 1H), 7.07 (m, 1H), 7.20 (d, 2H), 7.30 (d, 1H), 7.45 (m, 3H), 7.48 (d, 2H), 7.78 (d, 1H).
I-42	F	CH ₃	4-F	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.32 (d, 3H), 5.65 (q, 1H), 6.25 (s, 1H), 7.13 (d, 2H), 7.19 (t, 2H), 7.28 (d, 1H), 7.53 (d, 2H), 7.67 (dd, 2H), 7.77 (d, 1H).
I-43	F	CH ₃	4-F	4-Cl	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.31 (d, 3H), 5.63 (q, 1H), 6.21 (s, 1H), 7.18 (m, 4H), 7.30 (d, 1H), 7.44 (d, 2H), 7.65 (dd, 2H), 7.79 (d, 1H).
I-44	F	CH ₃	3-F	4-CH ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.28 (d, 3H), 2.15 (s, 3H), 5.66 (q, 1H), 6.07 (s, 1H), 6.96 (d, 2H), 7.04 (m, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.40 (m, 3H), 7.37 (d, 2H), 7.79 (d, 1H).
I-45	F	CH ₃	3-F, 4-F	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.32 (d, 3H), 5.68 (q, 1H), 6.35 (s, 1H), 7.14 (d, 2H), 7.28 (d, 1H), 7.46 (m, 2H), 7.53 (d, 2H), 7.70 (m, 1H), 7.75 (d, 1H).

實例編號	R ⁵	A	(R ³) _m	(R ²) _n	特徵
I-46	F	CH ₃	4-CH ₃	4-CH ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.28 (d, 3H), 2.14 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 5.58 (q, 1H), 5.90 (s, 1H), 6.92 (d, 2H), 7.12 (d, 2H), 7.30 (d, 1H), 7.32 (d, 2H), 7.47 (d, 2H), 7.80 (d, 1H).
I-47	F	CH ₃	3-F, 4-F	4-Cl	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.31 (d, 3H), 5.66 (q, 1H), 6.31 (s, 1H), 7.22 (d, 2H), 7.30 (d, 1H), 7.44 (m, 2H), 7.47 (d, 2H), 7.68 (m, 1H), 7.76 (d, 1H).
I-48	F	CH ₃	3-F	3-F, 4-F	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.32 (d, 3H), 5.67 (q, 1H), 6.35 (s, 1H), 7.10 (m, 1H), 7.25 (m, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.47 (m, 4H), 7.78 (d, 1H).
I-49	F	CH ₃	4-F	4-CH ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.28 (d, 3H), 2.15 (s, 3H), 5.62 (q, 1H), 6.02 (s, 1H), 6.95 (d, 2H), 7.15 (t, 2H), 7.31 (d, 1H), 7.34 (d, 2H), 7.62 (dd, 2H), 7.79 (d, 1H).
I-50	F	CH ₃	3-F, 4-F	4-CH ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.28 (d, 3H), 2.16 (s, 3H), 5.65 (q, 1H), 6.12 (s, 1H), 6.97 (d, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.36 (d, 2H), 7.42 (m, 2H), 7.62 (m, 1H), 7.77 (d, 1H).
I-51	F	CH ₃	3-F, 4-F	3-F, 4-F	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.32 (d, 3H), 5.66 (q, 1H), 6.40 (s, 1H), 7.24 (m, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.46 (m, 3H), 7.71 (m, 1H), 7.77 (d, 1H).
I-52	F	CH ₃	4-CH ₃	4-Cl	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.31 (d, 3H), 2.26 (s, 3H), 5.59 (q, 1H), 6.09 (s, 1H), 7.17 (m, 4H), 7.29 (d, 1H), 7.43 (d, 2H), 7.49 (d, 2H), 7.80 (d, 1H).
I-53	F	CH ₃	4-F	3-F, 4-F	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.31 (d, 3H), 5.63 (q, 1H), 6.30 (s, 1H), 7.20 (t, 2H), 7.21 (m, 2H), 7.31 (d, 1H), 7.42 (m, 1H), 7.68 (dd, 2H), 7.79 (d, 1H).
I-54	F	CH ₃	3-F, 4-F, 5-F	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.32 (d, 3H), 5.70 (q, 1H), 6.45 (s, 1H), 7.16 (d, 2H), 7.28 (d, 1H), 7.57 (d, 2H), 7.62 (dd, 2H), 7.73 (d, 1H).
I-55	F	CH ₃	3-F, 4-CF ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.33 (d, 3H), 5.76 (q, 1H), 6.50 (s, 1H), 7.17 (d, 2H), 7.30 (d, 1H), 7.59 (d, 2H), 7.70 (d, 1H), 7.79 (m, 3H).
I-56	F	CH ₃	4-CH ₃	4-CF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CD ₃ CN) δ 1.39 (d, 3H), 2.29 (s, 3H), 5.50 (q, 1H), 5.82 (s, 1H), 7.17–7.23 (m, 3H), 7.49 (d, 4H), 7.580 (d, 1H), 7.67 (d, 2H).

實例編號	R ⁵	A	(R ³) _m	(R ²) _n	特徴
I-57	F	CH ₃	4-CH ₃	3-F, 4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CD ₃ CN) δ 1.38 (d, 3H), 2.30 (s, 3H), 5.41 (q, 1H), 5.80 (s, 1H), 7.59-7.16 (m, 9H).
I-58	F	CH ₃	4-CH ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.32 (d, 3H), 2.26 (s, 3H), 5.62 (q, 1H), 6.12 (s, 1H), 7.11 (d, 2H), 7.16 (d, 2H), 7.27 (d, 1H), 7.53 (m, 4H), 7.78 (d, 1H).
I-59	F	CH ₃	4-CH ₃	3-F, 5-F, 4-CF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CD ₃ CN) δ 1.39 (d, 3H), 2.31 (s, 3H), 5.40 (q, 1H), 5.95 (s, 1H), 7.20-7.28 (m, 5H), 7.49 (d, 2H), 7.60 (d, 1H).
I-60	Cl	CH ₃	4-CH ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CD ₃ CN) δ 1.38 (d, 3H), 2.29 (s, 3H), 5.53 (q, 1H), 5.66 (s, 1H), 7.07 (dd, 2H), 7.18 (d, 2H), 7.31 (s, 1H), 7.48 (dd, 2H), 7.53 (dd, 2H), 7.64 (s, 1H).
I-61	NO ₂	CH ₃	4-CH ₃	4-CF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CD ₃ CN) δ 1.49 (d, 3H), 2.30 (s, 3H), 5.17 (s, 1H), 5.66 (q, 1H), 7.21 (d, 2H), 7.49 (dd, 4H), 7.61 (d, 2H), 7.88 (s, 1H), 8.43 (s, 1H).
I-62	F	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-F, 4-OCF ₃	¹ H NMR (600 MHz, CD ₃ CN) δ 1.18 (t, 3H), 1.38 (d, 3H), 2.61 (q, 2H), 5.43 (q, 1H), 5.81 (s, 1H), 7.20-7.57 (m, 9H).
I-63	F	CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (600 MHz, CD ₃ CN) δ 1.17 (t, 3H), 1.38 (d, 3H), 2.60 (q, 2H), 5.46 (q, 1H), 5.75 (s, 1H), 7.08 (d, 2H), 7.21 (m, 3H), 7.50 (d, 2H), 7.56 (m, 3H).
I-64	F	CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-CF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CD ₃ CN) δ 1.17 (t, 3H), 1.39 (d, 3H), 2.60 (q, 2H), 5.50 (q, 1H), 5.82 (s, 1H), 7.22 (m, 3H), 7.49 (dd, 4H), 7.58 (d, 1H), 7.68 (d, 2H).
I-65	F	CH ₃	4-SCH ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CD ₃ CN) δ 1.38 (d, 3H), 2.45 (s, 3H), 5.43 (q, 1H), 5.79 (s, 1H), 7.09 (d, 2H), 7.26 (m, 5H), 7.55 (m, 3H).
I-66	F	CH ₃	4-SCH ₃	4-CF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CD ₃ CN) δ 1.40 (d, 3H), 2.45 (s, 3H), 5.48 (q, 1H), 5.88 (s, 1H), 7.21 (m, 2H), 7.50 (m, 5H), 7.67 (dd, 2H).
I-67	F	CH ₃	4-CH ₃	3-F, 4-F, 5-F	¹ H NMR (400 MHz, CD ₃ CN) δ 1.37 (d, 3H), 2.30 (s, 3H), 5.35 (q, 1H), 5.83 (s, 1H), 7.20 (m, 5H), 7.47 (d, 2H), 7.57 (d, 1H).

實例編號	R ⁵	A	(R ³) _m	(R ²) _n	特徵
I-68	F	CH ₃	4-SCH ₃	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CD ₃ CN) δ 1.37 (d, 3H), 5.49 (q, 1H), 6.00 (s, 1H), 7.20 (m, 5H), 7.58 (m, 3H), 7.70 (m, 6H).
I-69	F	CH ₃	4-OCF ₃	4-CN	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.34 (d, 3H), 5.74 (q, 1H), 6.45 (s, 1H), 7.27 (d, 1H), 7.36 (d, 2H), 7.64 (s, 4H), 7.76 (m, 3H).
I-70	F	CH ₃	4-OCF ₃	4-CO ₂ CH ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.34 (d, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.74 (q, 1H), 6.37 (s, 1H), 7.27 (d, 1H), 7.36 (d, 2H), 7.60 (d, 2H), 7.76 (m, 5H).
I-71	F	CH ₃	4-I	4-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.31 (d, 3H), 5.62 (q, 1H), 6.25 (s, 1H), 7.13 (d, 2H), 7.28 (d, 1H), 7.44 (d, 2H), 7.51 (d, 2H), 7.70 (m, 3H).
I-72	F	CH ₃	4-I	4-CF ₃	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 1.33 (d, 3H), 5.70 (q, 1H), 6.35 (s, 1H), 7.27 (d, 1H), 7.46 (d, 2H), 7.48 (d, 2H), 7.64 (d, 2H), 7.72 (d, 2H), 7.80 (d, 1H).

生物實例

微小牛蟬(*Boophilus microplus*)注射試驗(BOOPMI Inj)

溶劑： 二甲亞砒

【0134】 製造合適之活性化合物製劑時，取 10 mg 活性化合物溶於 0.5 ml 溶劑中，使用溶劑稀釋該濃縮液至所需濃度。

【0135】 取 1 μ l 化合物溶液注射至 5 隻已充血之雌性微小牛蟬(*Boophilus microplus*)成蟲腹部，將牛蟬移至繁殖用培養皿，在人工氣候室內培養。

【0136】 7 天後，追蹤所產下可孵化的卵。將無法從目視觀察孵化性之卵存放在人工氣候室內，直到約 42 天後孵化為止。100%效力表示所有卵均無法孵化；0%表示所有卵均可孵化。

【0137】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 20 μ g/隻動物之施用率下顯示 100%之良好活性：I-1、I-9、I-24、I-30、I-67、I-69

【0138】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 20 μ g/隻動物之施用率下顯示 98%之良好活性：I-6

短古柏線蟲(*Cooperia curticei*)試驗(COOPCU)

溶劑： 二甲亞砒

【0139】 製造合適之活性化合物製劑時，取 10 mg 活性化合物溶於 0.5 ml 溶劑中，使用林格氏溶液(Ringer's solution)稀釋該濃縮液至所需濃度。

【0140】 取約 40 隻線蟲幼蟲(短古柏線蟲(*Cooperia curticei*))移至含有該化合物溶液之試管中。

【0141】 5 天後，記錄幼蟲死亡率%。100%係指殺死所有幼蟲；0%係指沒有殺死幼蟲。

【0142】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 100 ppm 之施用率下顯示 90%之良好活性：I-30

貓櫛頭蚤(*Ctenocephalides felis*)口服試驗(CTECFE)

溶劑： 二甲亞砒

【0143】 製備合適之活性化合物製劑時，取 10 mg 活性化合物溶於 0.5 ml 溶劑中。使用牛血稀釋該濃縮液至所需濃度。

【0144】 取約 20 隻未餵食之跳蚤成蟲(貓櫛頭蚤(*Ctenocephalides felis*))置入跳蚤瓶中。在一個血液瓶底部使用石蠟膜封口，填充含有化合物溶液之牛血，置於另一個頂部使用紗布覆蓋之跳蚤瓶上，因此可讓跳蚤吸血。血液瓶加溫至 37°C，而跳蚤瓶保持在室溫下。

【0145】 兩天後，測定死亡率%。100%表示已殺死所有跳蚤；0%表示沒有殺死任何跳蚤。

【0146】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 100 ppm 之施用率下展現 80%之良好活性：I-30

綿羊赤銅綠蠅(*Lucilia cuprina*)試驗(LUCICU)

溶劑： 二甲亞砒

【0147】 取 10 mg 活性化合物溶於 0.5 ml 二甲亞砒中。經過連續稀釋至得到所需濃度。

【0148】 取約 20 隻澳洲綿羊赤銅綠蠅(*Lucilia cuprina*)第一齡幼蟲移至包含碎馬肉與所需濃度之化合物溶液之試管中。

【0149】 2 天後，測定死亡率%。100%表示已殺死所有幼蟲；0%表示沒有殺死任何幼蟲。

【0150】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 100 ppm 之施用率下展現 100%之良好活性：I-1、I-3、I-4、I-5、I-6、I-9、I-24、I-30、I-69、I-70。

家蠅(*Musca domestica*)試驗(MUSCDO)

溶劑： 二甲亞砒

【0151】 製備合適之活性化合物製劑時，取 10 mg 活性化合物溶於 0.5 ml 溶劑中，加水稀釋該濃縮液至所需濃度。

【0152】 取 10 隻家蠅(*Musca domestica*)成蟲移至包含已浸泡過含糖溶液與所需濃度化合物溶液之混合物之海綿之容器中。

【0153】 2 天後，測定死亡率%。100%表示已殺死所有蠅；0%表示沒有殺死任何蠅。

【0154】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 100 ppm 之施用率下展現 100%之良好活性：I-1、I-5、I-6、I-9、I-24

【0155】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 100 ppm 之施用率下展現 90%之良好活性：I-30、I-70

【0156】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 100 ppm 之施用率下展現 80%之良好活性：I-3、I-4

南方根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*)試驗(MELGIN)

溶劑： 125.0 份重量比之丙酮

【0157】 製備合適之活性化合物製劑時，由 1 份重量比之活性化合物與指定量溶劑混合，並加水稀釋該濃縮液至所需濃度。

【0158】 在容器中填充砂子、活性成份溶液、包含南方根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*)之卵與幼蟲之懸浮液、及生菜萵苣(salad)種子。讓生菜萵苣種子發芽及長成幼苗。在根部形成蟲癭。

【0159】 14 天後，依據蟲癭之形成百分比決定殺線蟲活性%。100%係指沒有出現蟲癭；0%係指處理組植物根部之蟲癭數相當於未處理之對照組植物。

【0160】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 20 ppm 之施用率下展現 100%之良好活性：I-47

【0161】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 20 ppm 之施用率下展現 90%之良好活性：I-1、I-24、I-51、I-72

【0162】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 20 ppm 之施用率下展現 80%之良好活性：I-48、I-49

桃赤蚜(*Myzus persicae*)-噴灑試驗(MYZUPE)

溶劑： 78.0 份重量比丙酮

1.5 份重量比二甲基甲醯胺

乳化劑： 烷基芳基聚二醇醚

【0163】 製備合適之活性化合物製劑時，取 1 份重量比活性化合物與指定量溶劑混合，使用包含 1000ppm 乳化劑濃度之水稀釋至所需濃度。再使用包含乳化劑之水稀釋製成其他試驗濃度。

【0164】 在感染所有蟲齡之桃赤蚜(*Myzus persicae*)之捲心白菜(*Brassica pekinensis*)葉圓片上噴灑所需濃度之活性成份製劑。

【0165】 6 天後，測定死亡率%。100%表示已殺死所有蚜蟲；0%表示沒有殺死任何蚜蟲。

【0166】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 500 g/ha 之施用率下展現 100%之良好活性：I-3、I-6、I-14、I-45、I-56、I-71

【0167】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 500 g/ha 之施用率下展現 90%之良好活性：I-9、I-13、I-15、I-21、I-26、I-55、I-70

【0168】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 100 g/ha 之施用率下展現 90%之良好活性：I-7

秋行軍蟲(*Spodoptera frugiperda*)噴灑試驗(SPODFR)

溶劑： 78.0 份重量比丙酮

1.5 份重量比二甲基甲醯胺

乳化劑：烷基芳基聚二醇醚

【0169】 製備合適之活性化合物製劑時，取 1 份重量比活性化合物與指定量溶劑混合，使用包含 1000ppm 乳化劑濃度之水稀釋至所需濃度。再使用包含乳化劑之水稀釋製成其他試驗濃度。

【0170】 在玉米(*Zea mays*)葉圓片上噴灑所需濃度之活性成分製劑。一旦乾燥時，即感染秋行軍蟲(*Spodoptera frugiperda*)幼蟲。

【0171】 7 天後，測定死亡率%。100%表示已殺死所有幼蟲；0%表示沒有殺死任何幼蟲。

【0172】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 500 g/ha 之施用率下展現 100%之良好活性：I-1、I-3、I-5、I-6、I-9、I-13、I-22、I-24、I-31、I-45、I-54、I-55、I-56、I-57、I-58、I-60、I-65、I-69、I-70、I-71、I-72

【0173】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 500 g/ha 之施用率下展現 83%之良好活性：I-27、I-36、I-39、I-42、I-47、I-59、I-65

【0174】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 500 g/ha 之施用率下展現 80%之良好活性：I-21

【0175】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 100 g/ha 之施用率下展現 83%之良好活性：I-4、I-8、I-70 (100%)、I-71 (100%)

紅葉蟎(*Tetranychus urticae*)噴灑試驗 OP-抗性(TETRUR)

溶劑： 78.0 份重量比丙酮

1.5 份重量比二甲基甲醯胺

乳化劑：烷基芳基聚二醇醚

【0176】 製備合適之活性化合物製劑時，取 1 份重量比活性化合物與指定量溶劑混合，使用包含 1000ppm 乳化劑濃度之水稀釋至所需濃度。再使用包含乳化劑之水稀釋製成其他試驗濃度。

【0177】 在嚴重感染所有階段紅葉蟎(*Tetranychus urticae*)之菜豆(*Phaseolus vulgaris*)葉圓片上噴灑所需濃度之活性成份製劑。

【0178】 6 天後，測定死亡率%。100%表示已殺死所有蜘蛛蟎；0%表示沒有殺死任何蜘蛛蟎。

【0179】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 500 g/ha 之施用率下展現 100%之良好活性：I-1、I-3、I-5、I-9、I-22、I-55、I-69

【0180】 此試驗中，例如：下列製備實例之化合物在 500 g/ha 之施用率下展現 90%之良好活性：I-21、I-24、I-25、I-30、I-59、I-65、I-66、I-70、I-71

按蚊(*Anopheles*)試驗(ANPHGB 接觸經過處理之表面之生物分析法)

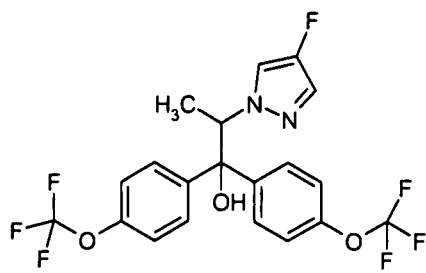
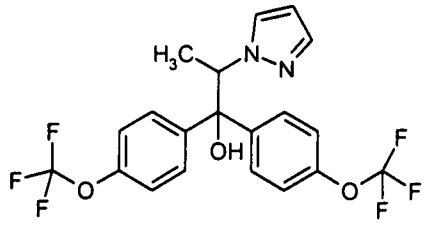
溶劑： 丙酮

【0181】 製造適當之活性成分調配物時，取 2 mg 活性物質溶於 1 ml 丙酮。吸取此溶液至一片上釉之磁磚上。丙酮蒸發後，放上甘比亞瘧蚊(*Anopheles gambiae*)(純合子 *kdr*)成蟲到經過處理之磁磚上。曝露時間為 30 分鐘。

【0182】 與經過處理之表面接觸後 2 小時，計算出現擊倒症狀之試驗動物數量。此時，100%之效力表示所有蚊子均出現被擊倒症狀；0%之效力表示沒有任何蚊子出現被擊倒症狀。

【0183】 此試驗中，下列本發明實例在 100 mg/m² 之濃度下展現 90 至 100%之效力：I-56、I-57、I-59、I-62、I-63、I-64、I-55、I-54、I-3、I-6、I-7、I-8、I-10、I-26、I-9、I-25、I-1、I-12、I-11、I-16、I-13、I-14、I-15、

I-17、I-18、I-22、I-24、I-30、I-29、I-31、I-32、I-33、I-36、I-38、I-35、
I-34、I-40、I-50、I-42、I-58、I-45、I-2

實例	濃度[mg/m ²]	效力[%]
I-6 	0.8	90
EP 0 158 448, 實例 XIX 	0.8	30

伊蚊(Aedes)試驗(AEDSAE 接觸經過處理之表面之生物分析法)

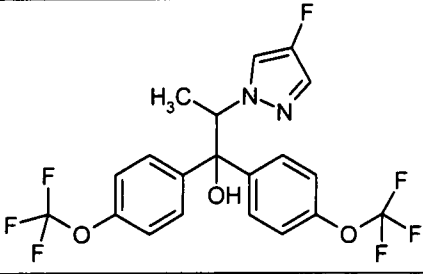
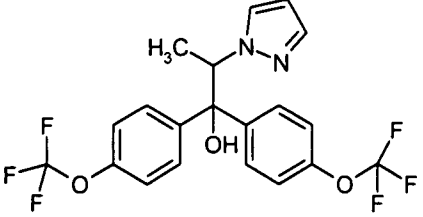
溶劑：丙酮

【0184】 製造適當之活性成分調配物時，取 2 mg 活性物質溶於 1 ml 丙酮。吸取此溶液至一片上釉之磁磚上。丙酮蒸發後，放上埃及伊蚊(*Aedes aegypti*) 成蟲到經過處理之磁磚上。曝露時間為 30 分鐘。

【0185】 與經過處理之表面接觸後 2 小時，計算出現擊倒症狀之試驗動物數量。此時，100%之效力表示所有蚊子均出現被擊倒症狀；0%之效力表示沒有任何蚊子出現被擊倒症狀。

【0186】 此試驗中，下列本專利案實例之化學化合物在 100 mg/m² 之濃度下展現 90 至 100%之效力：I-56、I-57、I-59、I-62、I-63、I-64、I-51、I-55、I-54、I-3、I-4、I-6、I-7、I-8、I-10、I-26、I-9、I-25、I-1、I-12、I-11、I-16、I-13、I-14、I-15、I-17、I-18、I-19、I-20、I-22、I-21、I-23、I-24、I-28、I-30、I-29、I-31、I-32、I-33、I-36、I-37、I-39、I-38、I-34、I-35、I-41、I-40、I-48、I-43、I-52、I-47、I-46、I-50、I-42、I-58、I-45、I-53、I-2、I-67、I-68

實例	濃度[mg/m ²]	效力[%]
I-6	0.8	100

		
EP 0 158 448, 實例 XIX 	0.8	10

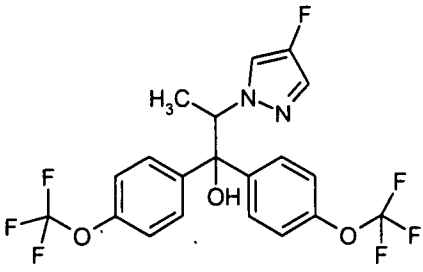
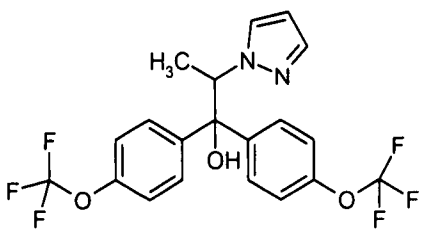
庫蚊(Culex)試驗(CULXFA 接觸經過處理之表面之生物分析法)

溶劑：丙酮

【0187】 製造適當之活性成分調配物時，取 2 mg 活性物質溶於 1 ml 丙酮。吸取此溶液至一片上釉之磁磚上。丙酮蒸發後，放上致倦庫蚊(Culex quinquefasciatus)成蟲到經過處理之磁磚上。曝露時間為 30 分鐘。

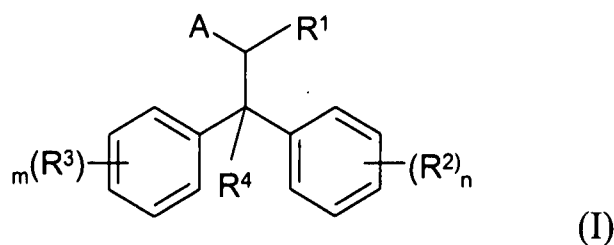
【0188】 與經過處理之表面接觸後 2 小時，計算出現擊倒症狀之試驗動物數量。此時，100%之效力表示所有蚊子均出現被擊倒症狀；0%之效力表示沒有任何蚊子出現被擊倒症狀。

【0189】 此試驗中，下列本專利案實例之化學化合物在 100 mg/m² 之濃度下展現 90 至 100%之效力：I-57、I-59、I-6、I-52、I-58。

實例	濃度[mg/m ²]	效力[%]
I-6 	0.8	100
EP 0 158 448, 實例 XIX 	0.8	60

申請專利範圍

1. 一種式(I)化合物，



其中

- A 代表(C₁-C₄)烷基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)鹵烷基或(C₃-C₆)鹵環烷基，較佳為甲基；
- R¹ 代表單-或二取代之 1-吡唑基，其中至少一個取代基位於 1-吡唑基之 4-位置，且其中一個取代基係分別獨立選自下列各物所組成之群中：鹵基、氰基、(C₁-C₄)烷基、(C₃-C₆)環烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₃-C₆)鹵環烷基、或(C₁-C₄)鹵烷氧基；
- n 代表 0、1、2、3、4 或 5；較佳為 1、2 或 3；
- R² 分別獨立代表鹵基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷氧基、(C₁-C₄)硫烷基、(C₁-C₄)鹵硫烷基、(C₃-C₆)環烷基、(C₃-C₆)鹵環烷基、氰基、硝基、-CO(O)-(C₁-C₄)烷基、-(C₁-C₄)烷基-C(O)O-(C₁-C₄)烷基、-(C₁-C₄)鹵烷基-C(O)O-(C₁-C₄)鹵烷基、或-(C₁-C₄)鹵烷基-C(O)O-(C₁-C₄)鹵烷基；或基本結構之苯基環上相鄰環位置之兩個 R² 可與該兩個相鄰環位置共同形成可視需要經鹵基取代之 5 或 6-員碳環系或雜環系；
- m 代表 0、1、2、3、4 或 5；較佳為 0、1、2 或 3，更佳為 1 或 2；
- R³ 分別獨立代表鹵基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)鹵烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)鹵烷氧基、(C₁-C₄)硫烷基、(C₁-C₄)鹵硫烷基、(C₃-C₆)環烷基、(C₃-C₆)鹵環烷基、氰基、硝基、-CO(O)-(C₁-C₄)烷基、-(C₁-C₄)烷基-C(O)O-(C₁-C₄)鹵烷基、-(C₁-C₄)鹵烷基-C(O)O-(C₁-C₄)鹵烷基或-(C₁-C₄)鹵烷基-C(O)O-(C₁-C₄)鹵烷基；或基本結構之苯基環上相鄰環位置的兩個 R³ 可與該兩個相鄰環位置共

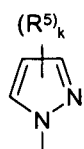
同形成可視需要經鹵基取代之 5 或 6-員碳環系或雜環系；

R^4 代表羥基、鹵基、 (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、 (C_1-C_4) 硫烷基、 (C_1-C_4) 鹵硫烷基、 $O-(C_2-C_5)$ 醯基、或 $O-(C_2-C_5)$ 鹵醯基；

及式(I)化合物之鹽類、N-氧化物與互變異構型。

2. 根據請求項 1 之式(I)化合物，其中 A 代表 (C_1-C_2) 烷基，較佳為甲基。

3. 根據請求項 1 或 2 之式(I)化合物，其中

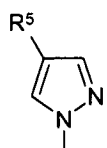


R^1 代表 \cdot ，

k 代表 1 或 2，及

R^5 代表氟基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 鹵烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 鹵烷氧基或鹵基，較佳為氟、氯或氟基，更佳係氟或氟基，但其限制條件為至少一個取代基 R^5 位於 1-吡唑基之 4-位置。

4. 根據請求項第 1 至 3 項中任一項之式(I)化合物，其中

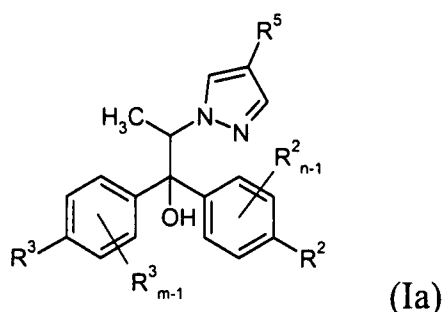


R^1 代表 \cdot 及

R^5 代表氟基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 鹵烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 鹵烷氧基或鹵基，較佳為氟、氯或氟基，更佳係氟或氟基，最佳係氟。

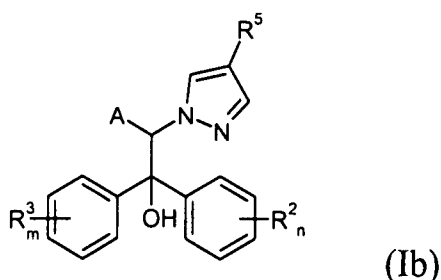
5. 根據請求項 1 至 4 中任一項之式(I)化合物，其中 R^2 代表甲基、 (C_1-C_3) 鹵烷基、 (C_1) 鹵烷氧基、 (C_1) 鹵硫烷基、氟或氯；或基本結構之苯基環上相鄰環位置之兩個 R^2 與該兩個相鄰環位置共同形成可視需要經鹵基取代之 5-員雜環，較佳為經氟取代，其包含兩個選自下列各物所組成之群中之雜原子：N 或 O，較佳為 O。

6. 根據請求項 1 至 5 中任一項之式(I)化合物，其中 R^3 代表甲基、鹵甲基、 (C_1) 鹵烷氧基或鹵基，如：氟或氯。
7. 根據請求項 1 至 7 中任一項之式(I)化合物，其中該式(I)化合物為式(Ia)化合物



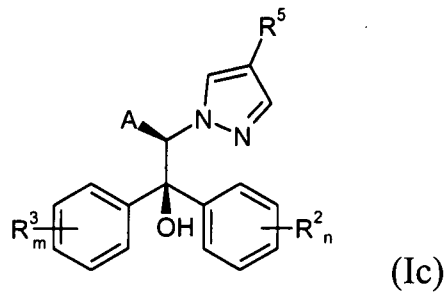
其中 R^2 、 R^3 、 R^5 係如請求項 1 至 6 中任一項之定義，且 n 為 1、2 或 3，及 m 為 1、2 或 3，較佳為其中 R^5 為氰基、氯或氟，更佳為氰基或氟，最佳係氟。

8. 根據請求項 1 至 8 中任一項之式(I)化合物，其中該式(I)化合物為式(Ib)化合物



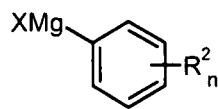
其中 R^2 、 R^3 、 R^5 、 n 、與 m 係如請求項 1 至 6 中任一項之定義，較佳為其中 R^5 為氰基、氯或氟，更佳為氰基或氟，及 A 代表 (C_1-C_4) 烷基。

9. 根據請求項 1 至 8 中任一項之式(I)化合物，其中該式(I)化合物為式(1c)化合物或式(1c)化合物之對映異構物或該兩種對映異構物之混合物，

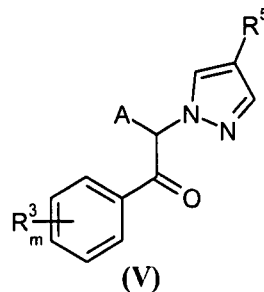


其中 A、R²、R³、R⁵、n、與 m 係如請求項第 1 至 9 項中任一項之定義，較佳係其中 R⁵ 為氰基或氟，及 A 為甲基。

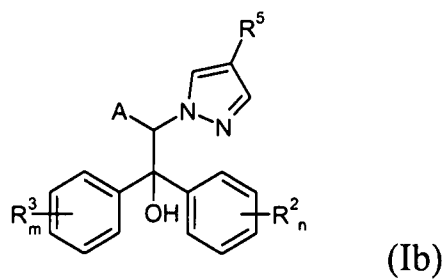
10. 一種組成物，其特徵在於其包含至少一種根據請求項 1 至 9 中任一項之式(I)化合物與習知之補充劑與/或界面活性劑。
11. 一種控制有害昆蟲之方法，其特徵在於使根據請求項 1 至 9 中任一項之式(I)化合物或根據請求項 10 之組成物作用在害蟲與/或其棲息地上。
12. 一種根據請求項 1 至 9 中任一項之式(I)化合物或根據請求項 10 之組成物於控制昆蟲之用途。
13. 一種製造根據請求項 8 之化合物(Ib)之方法，其特徵在於由如下式化合物



與式(V)化合物反應

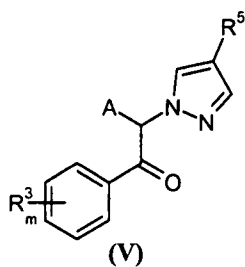


產生式(Ic)化合物



其中 R^2 、 R^3 、 R^5 、 n 、與 m 係如請求項 1 至 6 中任一項之定義，較佳為其中 R^5 為氰基、氯或氟，更佳為氰基或氟。

14. 一種根據式(V)之化合物



其中 R^3 、 R^5 與 m 係如請求項 1 至 6 中任一項之定義。

圖式

圖 1: 帶有標記圖示之 I-2 之消旋物之不對稱單位之 Ortep 圖(50 %)

