



(12)发明专利

(10)授权公告号 CN 106715428 B

(45)授权公告日 2020.07.07

(21)申请号 201580049811.3

A·布驰赫尔兹

(22)申请日 2015.09.09

(74)专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专

(65)同一申请的已公布的文献号

利商标事务所 11038

申请公布号 CN 106715428 A

代理人 张敏

(43)申请公布日 2017.05.24

(51)Int.Cl.

(30)优先权数据

C07D 471/04(2006.01)

14184887.9 2014.09.16 EP

A01N 43/90(2006.01)

(85)PCT国际申请进入国家阶段日

A01P 7/00(2006.01)

2017.03.16

A01P 7/02(2006.01)

A01P 7/04(2006.01)

(86)PCT国际申请的申请数据

(56)对比文件

PCT/EP2015/070537 2015.09.09

JP 2008308448 A,2008.12.25,

(87)PCT国际申请的公布数据

WO 2011090127 A1,2011.07.28,

W02016/041819 EN 2016.03.24

CN 103261170 A,2013.08.21,

(73)专利权人 先正达参股股份有限公司

CN 103717598 B,2016.12.07,

地址 瑞士巴塞尔

CN 104394694 A,2015.03.04,

CN 104379567 A,2015.02.25,

(72)发明人 A·埃德蒙兹 M·米尔巴赫

审查员 吴姗姗

P·J·M·容 A·杰恩格纳特

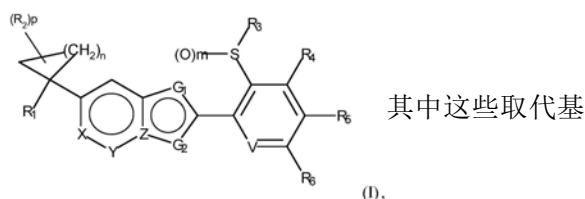
权利要求书2页 说明书67页

(54)发明名称

具有含硫取代基的杀有害生物活性四环衍生物

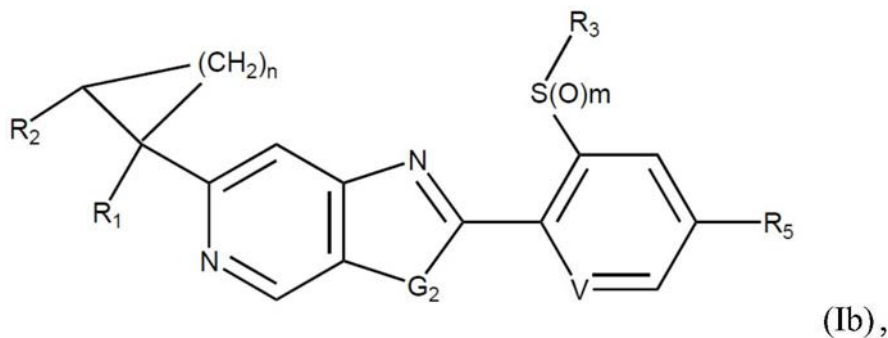
(57)摘要

具有化学式(I)的化合物



是如在权利要求1中所定义的,以及那些化合物的农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体和N-氧化物,可以用作杀昆虫剂并且可按照本身已知的方法制备。

1. 具有化学式 (Ib) 的化合物



其中

R₁是氢、三氟甲基或氰基；

R₂是氢或氰基；

R₃是C₁-C₃烷基、C₃-C₄环烷基或C₃-C₄环烷基-C₁-C₄烷基；

R₅是氢、三氟甲基、卤素、4-(三氟甲基)-苯基、5-(三氟甲基)-2-吡啶基、4-氯-苯基或5-氯-2-吡啶基；

G₂是被C₁-C₂烷基取代的氮；

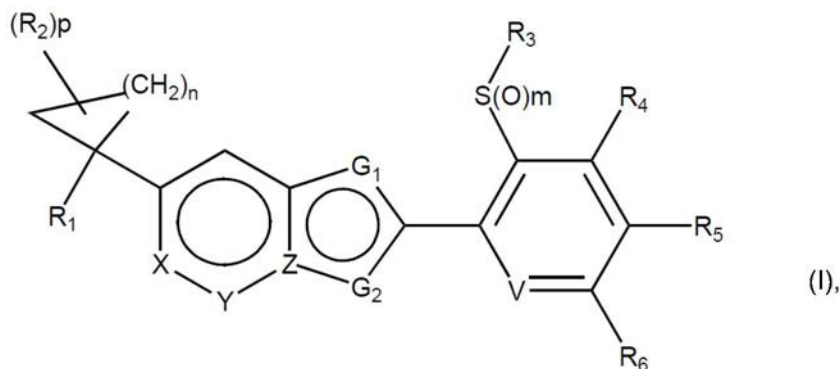
V是氮；

n是1或2；

m是2；

或具有化学式 (Ib) 的化合物的农用化学上可接受的盐。

2. 具有化学式 (I) 的化合物



其中

R₁是氢或氰基；

R₂是氢；

R₃是C₁-C₄烷基；

R₄是氢；

R₅是C₁-C₄卤代烷基；

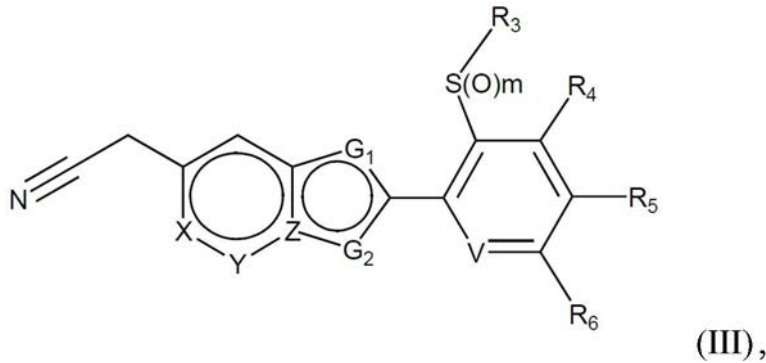
R₆是氢；

p是1；

n是1或2；

m是2；

- X是CH;
 Y是N;
 Z是碳;
 G₁是N;
 G₂是N-R₇;
 R₇是C₁-C₄烷基;并且
 V是N;
 或具有化学式(I)的化合物的农用化学上可接受的盐。
 3. 一种具有化学式(III)的化合物,



其中G₂、R₃、R₅、m和V具有如在权利要求1中的化学式(Ib)下所描述的定义;

- G₁是N;
 X是N;
 Y是CH;
 Z是碳;
 R₄是氢;并且
 R₆是氢;

或具有化学式(Ib)的化合物的农用化学上可接受的盐。

4. 一种杀有害生物组合物,该杀有害生物组合物包含至少一种根据权利要求1所述的具有化学式Ib或根据权利要求2所述的具有化学式I的化合物或适当时其互变异构体作为活性成分以及至少一种助剂,该化合物在所有情况下为游离形式或农用化学上可用的盐形式。

5. 一种用于控制有害生物的方法,该方法包括将根据权利要求4所述的组合物施用于这些有害生物或其环境中,除了通过手术或疗法用于处理人或动物体的方法以及对于人或动物体实施的诊断方法之外。

6. 一种用于保护植物繁殖材料免受有害生物攻击的方法,该方法包括用根据权利要求4所述的组合物处理该繁殖材料或该繁殖材料所种植的场所。

7. 一种选自无纺和织物材料的基质,该材料包含根据权利要求4所述的组合物。

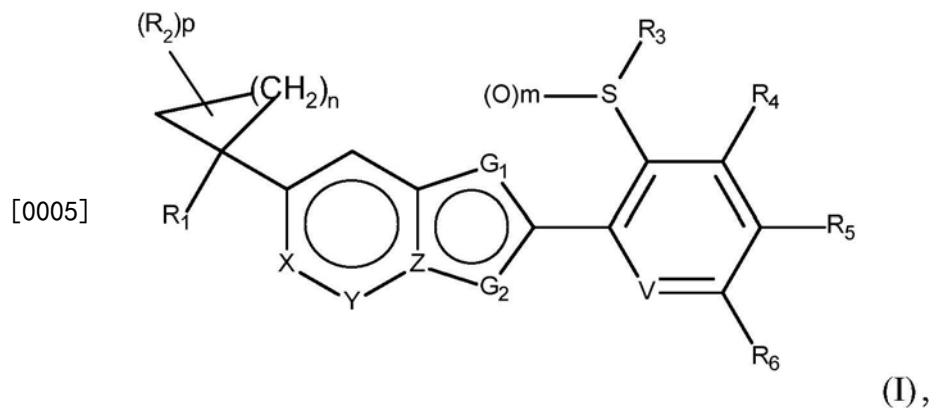
具有含硫取代基的杀有害生物活性四环衍生物

[0001] 本发明涉及包含硫取代基的杀昆虫活性四环衍生物,涉及包含那些化合物的组合物,并且涉及它们用于控制动物有害生物(包括节肢动物并且特别是昆虫或蜱螨目的代表)的用途。

[0002] 具有杀有害生物作用的含硫杂环化合物是已知的并且描述于例如WO 2013/018928、WO 2013/187423和WO 2012/086848中。

[0003] 现在已经发现具有杀有害生物特性的新颖的含硫杂环衍生物。

[0004] 本发明因此涉及具有化学式 (I) 的化合物,



[0006] 其中

[0007] R₁和R₂彼此独立地是氢、C₁-C₆烷基、C₁-C₆卤代烷基、氰基、硝基、C(O)R₈、C(O)OR₉、CONR₁₀R₁₁或S(O)_mR₁₂;

[0008] R₃是C₁-C₃烷基、C₁-C₃卤代烷基、C₃-C₅卤代环烷基、C₃-C₆环烷基-C₁-C₄烷基、C₃-C₅环烷基或C₃-C₆卤代环烷基-C₁-C₄烷基;

[0009] R₄和R₆是氢、卤素或C₁-C₃烷基;

[0010] R₅是氢、卤素、氰基、硝基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷基、或被选自下组的取代基单取代或多取代的C₁-C₄烷基,该组由以下各项组成:卤素、羟基、C₁-C₄卤代烷氧基、C₁-C₄烷氧基和氰基;或是C₃-C₆环烷基、或被选自下组的取代基单取代或多取代的C₃-C₆环烷基,该组由以下各项组成:C₁-C₄烷基和卤素;或

[0011] R₅是C₂-C₆烯基、C₂-C₆卤代烯基、C₂-C₆炔基、C₂-C₆卤代炔基;或

[0012] R₅是可以被选自下组的取代基单取代或多取代的苯基,该组由以下各项组成:卤素、氰基、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₁-C₄卤代烷氧基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄卤代烷基硫烷基、C₁-C₄卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄卤代烷基磺酰基和-C(O)C₁-C₄卤代烷基;或

[0013] R₅是C₁-C₄卤代烷基硫烷基、C₁-C₄卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄卤代烷基磺酰基、五氟代硫烷基、C₁-C₄卤代烷氧基、-C(O)C₁-C₄烷基、C₁-C₄烷基硫烷基、C₁-C₄烷基亚磺酰基或C₁-C₄烷基磺酰基;或

[0014] R₅是嘧啶或吡啶,这两者均可以被选自下组的取代基单取代或多取代,该组由以下各项组成:卤素、氰基、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₁-C₄卤代烷氧基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄烷基硫烷基、C₁-C₄烷基亚磺酰基、C₁-C₄烷基磺酰基、C₁-C₄卤代烷基硫烷基、C₁-C₄卤代烷基亚磺

酰基、C₁-C₄卤代烷基磺酰基和-C(O)C₁-C₄烷基；

[0015] X是氮或CR₁₃；

[0016] Y是氮或CR₁₄；

[0017] G₁是氮或CR₁₅；

[0018] V是氮或CH；

[0019] Z是氮并且G₂是氮或CR₁₆；或

[0020] Z是碳并且G₂是N-R₇、硫、氧或CR₁₆；

[0021] R₇是氢、C₁-C₄烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₁-C₄烷氧基-C₁-C₄烷基或C₃-C₆环烷基；

[0022] R₈、R₉、R₁₀、R₁₁和R₁₂彼此独立地是氢、C₁-C₆烷基、C₁-C₆卤代烷基、C₃-C₆环烷基、C₃-C₆卤代环烷基或C₁-C₆烷氧基-C₁-C₆烷基，其条件是当m₁是2时，R₁₂不同于氢；

[0023] R₁₃、R₁₄、R₁₅和R₁₆彼此独立地是氢、卤素、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、被一个或多个甲氧基基团取代的C₁-C₄卤代烷基，或R₁₃、R₁₄、R₁₅和R₁₆彼此独立地是C₁-C₄卤代烷基硫烷基、C₁-C₄卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄卤代烷基磺酰基、C₁-C₄卤代烷氧基、苯基羰基硫烷基、氰基、巯基、或C₁-C₄烷氧基羰基；

[0024] n是1或2；

[0025] m是0、1或2；

[0026] m₁是0、1或2；

[0027] p是1、2、3或4；

[0028] 以及那些化合物的农用化学上可接受的盐和N-氧化物。

[0029] 在取代基定义中出现的烷基基团可以是直链的或支链的，并且是例如甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、戊基以及己基。烷氧基、烯基和炔基基团衍生自所提及的烷基基团。烯基和炔基基团可以是单或多不饱和的。

[0030] 卤素通常是氟、氯、溴或碘。相应地，这也适用于与其他含义结合的卤素，例如卤代烷基或卤代苯基。

[0031] 卤代烷基基团具有从1至6个碳原子的链长。卤代烷基是例如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、2,2,2-三氟乙基、2-氟乙基、2-氯乙基、五氟乙基、1,1-二氟-2,2,2-三氯乙基、2,2,3,3-四氟乙基以及2,2,2-三氯乙基；优选是三氯甲基、二氟氯甲基、二氟甲基、三氟甲基以及二氯氟甲基，尤其是三氟甲基。

[0032] 烷氧基基团优选地具有从1至6个碳原子的链长。烷氧基是例如甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基和叔丁氧基并且还是同分异构的戊氧基以及己氧基基团；优选是甲氧基和乙氧基。烷氧基烷基基团具有1至6个碳原子的链长。烷氧基烷基是例如甲氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基甲基、乙氧基乙基、正丙氧基甲基、正丙氧基乙基、异丙氧基甲基或异丙氧基乙基。

[0033] 环烷基基团优选地具有从3至6个环碳原子，例如环丙基、环丁基、环戊基和环己基。苯基，还作为一个取代基（例如苯氧基、苄基、苄氧基、苯甲酰基、苯基硫烷基、苯基烷基、苯氧基烷基）的部分，是可以被取代的。在这种情况下，这些取代基可以是处于邻位、间位和/或对位。优选的取代位置是该环衔接位点的邻位与对位位置。

[0034] 在本发明的上下文中，取代基定义中的“单到多取代的”典型地是指，取决于取代基的化学结构，单取代的到七次取代的，优选是单取代的到五次取代的，更优选是单、二或

三取代的。

[0035] 取决于m的含义,基团 $(O)_m-S$ 可以代表硫烷基、亚磺酰基或磺酰基基团。

[0036] 取代基 R_2 可以位于环烷基环的每个化学上可能的位置。因此,基团 $(CH_2)_n$ 也可以代表 $-(CHR_2)-$ 、 $-(C(R_2)R_2)-$ 或 $-(CH_2-C(R_2)H)-$ 。

[0037] 具有至少一个碱性中心的具有化学式(I)的化合物可以与以下酸形成例如酸加成盐,这些酸为:例如强无机酸(例如矿物酸,例如高氯酸、硫酸、硝酸、磷酸或氢卤酸),强有机羧酸(例如未经取代的或像被卤素取代的 C_1-C_4 烷羧酸,例如乙酸(像饱和或不饱和的二羧酸),例如草酸、丙二酸、琥珀酸、马来酸、富马酸或邻苯二甲酸(像羟基羧酸),例如抗坏血酸、乳酸、苹果酸、酒石酸或柠檬酸,或像苯甲酸),或有机磺酸(例如未经取代的或像被卤素取代的 C_1-C_4 烷-或芳基磺酸,例如甲烷-或对甲苯磺酸)。具有至少一个酸性基团的具有化学式(I)的化合物可以例如,与碱形成盐(例如矿物盐(像碱金属或碱土金属盐,例如钠盐、钾盐或镁盐)),与氨或有机胺(像吗啉、哌啶、吡咯烷、单-、二-或三-低级-烷基胺(例如乙基-、二乙基-、三乙基-或二甲基丙胺),或单-、二-或三羟基-低级-烷基胺(例如单-、二-或三乙醇胺))形成盐。

[0038] 具有化学式(I)的这些化合物的盐能以本身已知的方式进行制备。因此,例如,具有化学式(I)的化合物的酸加成盐是通过用适合的酸或合适的离子交换试剂进行处理来获得的,并且与碱的盐是通过用适合的碱或用合适的离子交换试剂进行处理来获得的。

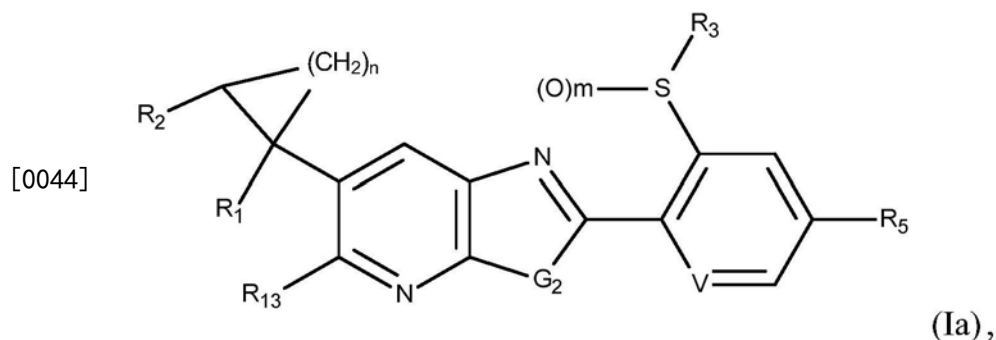
[0039] 具有化学式(I)的化合物的盐能以常规方式转化为游离的化合物(I)、酸加成盐(例如通过用合适的碱性化合物或用合适的离子交换试剂进行处理)以及碱盐(例如通过用合适的酸或用合适的离子交换试剂进行处理)。

[0040] 具有化学式(I)的化合物的盐能以本身已知的方式转化为具有化学式(I)的化合物的其他盐、酸加成盐,例如转变成为其他酸加成盐,例如通过在合适的溶剂中用酸的合适的金属盐(如钠盐、钡盐或银盐,例如用乙酸银)来处理无机酸的盐(如盐酸盐),在该溶剂中,所形成的无机盐(例如氯化银)是不溶的并且因此从该反应混合物中沉淀出。

[0041] 取决于程序或反应条件,具有成盐特性的具有化学式(I)的化合物能以游离形式或以盐的形式获得。

[0042] 具有化学式(I)的化合物以及适当时其互变异构体(在每种情况下处于游离形式或盐形式)如果适当的话还能以水合物的形式获得和/或包括其他的溶剂,例如可以用于使以固体形式存在的化合物的结晶的那些。

[0043] 具有化学式(I)的化合物的优选的组由具有化学式(Ia)的化合物表示



[0045] 其中;

[0046] R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_5 、 R_{13} 、 V 、 n 和 m 是如上文在化学式(I)中所定义的,并且 G_2 是氧、硫或是被氢或被 C_1 - C_2 烷基取代的氮。优选的具有化学式(Ia)的化合物是以下那些,其中

[0047] n 是1或2。

[0048] 尤其优选的具有化学式(Ia)的化合物是以下那些,其中

[0049] R_1 是氢、三氟甲基或氰基;

[0050] R_2 是氢或氰基;

[0051] R_3 是 C_1 - C_3 烷基、 C_3 - C_4 环烷基或 C_3 - C_4 环烷基- C_1 - C_4 烷基;

[0052] R_5 是氢、 C_1 - C_6 -卤代烷基、卤素、可被选自 C_1 - C_4 -卤代烷基或卤素的取代基单取代或二取代的苯基、或是可被选自 C_1 - C_4 -卤代烷基或卤素的取代基单取代或二取代的吡啶基;特定地

[0053] R_5 是氢、三氟甲基、卤素、4-(三氟甲基)-苯基、5-(三氟甲基)-2-吡啶基、4-氯-苯基或5-氯-2-吡啶基。

[0054] 优选地,在化学式(Ia)中, G_2 是被 C_1 - C_2 烷基取代的氮。

[0055] 优选的化合物还是其中 R_{13} 是氢、4-(三氟甲基)-2-吡啶基、5-(三氟甲基)-3-吡啶基或2-(三氟甲基)-4-吡啶基的那些。最优选的化合物是其中 R_{13} 是氢的那些。

[0056] 优选地,在化学式(Ia)中, V 是氮并且 m 是2。

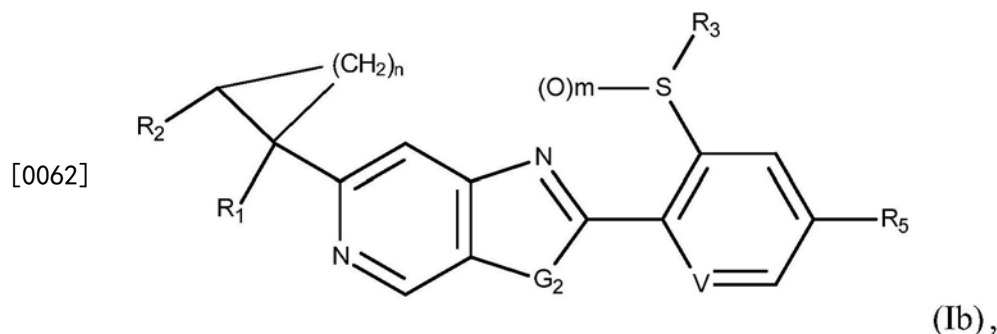
[0057] 甚至更高度优选的具有化学式(Ia)的化合物是其中 n 是1或2,并且 R_1 是氰基的那些;

[0058] 具有化学式(Ia)的化合物的进一步优选的组是其中 n 是1或2,并且 R_1 是三氟甲基的那些。

[0059] 另一组优选的具有化学式(Ia)的化合物是其中 V 是CH的那些。

[0060] 具有化学式(Ia)的化合物的进一步优选的组是其中 R_1 是氢并且 R_2 是氰基的那些。

[0061] 具有化学式(I)的化合物的进一步优选的组由具有化学式(Ib)的化合物表示



[0063] 其中

[0064] R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_5 、 V 、 n 和 m 是如上文在化学式(I)中所定义的,并且 G_2 是氧、硫或被氢或被 C_1 - C_2 烷基取代的氮。优选的具有化学式(Ib)的化合物是以下那些,其中

[0065] n 是1或2。

[0066] 尤其优选的具有化学式(Ib)的化合物是以下那些,其中

[0067] R_1 是氢、三氟甲基或氰基;

[0068] R_2 是氢或氰基;

[0069] R_3 是 C_1 - C_3 烷基、 C_3 - C_4 环烷基或 C_3 - C_4 环烷基- C_1 - C_4 烷基;

[0070] R_5 是氢、 C_1 - C_6 -卤代烷基、卤素、可被选自 C_1 - C_4 -卤代烷基或卤素的取代基单取代或

二取代的苯基、或是可被选自C₁-C₄-卤代烷基或卤素的取代基单取代或二取代的吡啶基；特定地

[0071] R₅是氢、三氟甲基、卤素、4-(三氟甲基)-苯基、5-(三氟甲基)-2-吡啶基、4-氯-苯基或5-氯-2-吡啶基。

[0072] 优选地，在化学式 (Ib) 中，G₂是被C₁-C₂烷基取代的氮。

[0073] 优选地，在化学式 (Ib) 中，V是氮并且m是2。

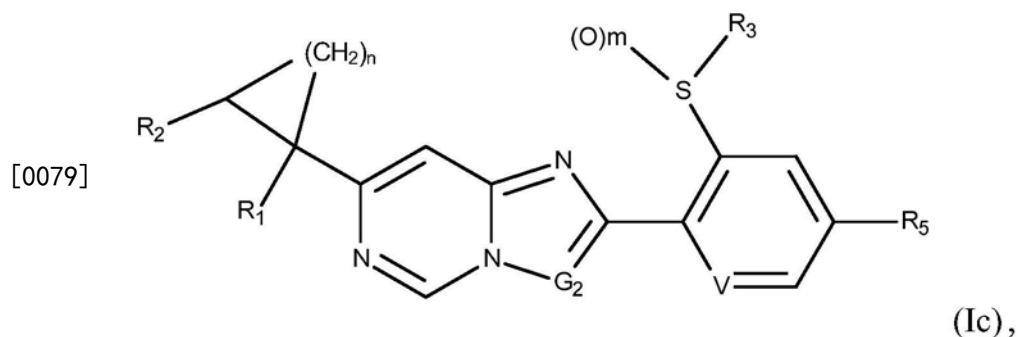
[0074] 甚至更高度优选的具有化学式 (Ib) 的化合物是其中n是1或2并且R₁是氰基的那些；

[0075] 具有化学式 (Ib) 的化合物进一步优选的组是其中n是1或2，并且R₁是三氟甲基的那些。

[0076] 另一组优选的具有化学式 (Ib) 的化合物是其中V是CH的那些。

[0077] 具有化学式 (Ib) 的化合物的进一步优选的组是其中R₁是氢并且R₂是氰基的那些。

[0078] 具有化学式 (I) 的化合物的进一步优选的组由具有化学式 (Ic) 的化合物表示



[0080] 其中

[0081] R₁、R₂、R₃、R₅、V、n和m是如上文在化学式 (I) 中所定义的，G₂是氮或G₂是次甲基或CH-CH₃。

[0082] 优选的具有化学式 (Ic) 的化合物是以下那些，其中

[0083] n是1或2；

[0084] R₁是氢、氰基或三氟甲基；

[0085] R₂是氢或氰基；

[0086] R₃是C₁-C₃烷基、C₃-C₄环烷基或C₃-C₄环烷基-C₁-C₄烷基；

[0087] R₅是氢、C₁-C₆-卤代烷基、卤素、可被选自C₁-C₄-卤代烷基或卤素的取代基单取代或二取代的苯基、或是可被选自C₁-C₄-卤代烷基或卤素的取代基单取代或二取代的吡啶基；特定地

[0088] R₅是氢、三氟甲基、卤素、4-(三氟甲基)-苯基、5-(三氟甲基)-2-吡啶基、4-氯-苯基或5-氯-2-吡啶基。

[0089] 优选地，在具有化学式 (Ic) 的化合物中，R₂是氢并且R₁是氰基。

[0090] 在具有化学式 (Ic) 的化合物的进一步优选的组中，R₁是三氟甲基。

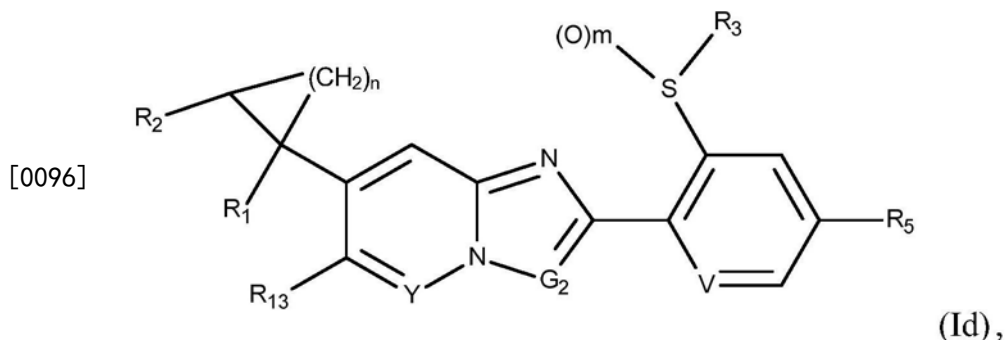
[0091] 在具有化学式 (Ic) 的化合物的另一个进一步优选的组中，G₂是氮。

[0092] 进一步优选的组是那些具有化学式 (Ic) 的化合物，其中G₂是次甲基。

[0093] 优选的还有具有化学式 (Ic) 的化合物，V是氮并且m是2。

[0094] 进一步优选的具有化学式 (Ic) 的化合物是其中V是CH的那些。

[0095] 具有化学式I的化合物的进一步优选的组由具有化学式(Id)的化合物表示



[0097] 其中

[0098] R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_5 、 R_{12} 、 V 、 Y 、 n 和 m 是如上文在化学式(I)中所定义的, G_2 是氮或 G_2 是次甲基或 $CH-CH_3$ 。

[0099] 优选的具有化学式(Id)的化合物是以下那些, 其中

[0100] n 是1或2;

[0101] R_1 是氢、氰基或三氟甲基;

[0102] R_2 是氢或氰基;

[0103] R_3 是 C_1-C_3 烷基、 C_3-C_4 环烷基或 C_3-C_4 环烷基- C_1-C_4 烷基;

[0104] R_5 是氢、 C_1-C_6 -卤代烷基、卤素、可被选自 C_1-C_4 -卤代烷基或卤素的取代基单取代或二取代的苯基、或是可被选自 C_1-C_4 -卤代烷基或卤素的取代基单取代或二取代的吡啶基; 特定地

[0105] R_5 是氢、三氟甲基、卤素、4-(三氟甲基)-苯基、5-(三氟甲基)-2-吡啶基、4-氯-苯基或5-氯-2-吡啶基。

[0106] 优选的具有化学式(Id)的化合物是其中 R_{13} 是氢、4-(三氟甲基)-2-吡啶基、5-(三氟甲基)-3-吡啶基或2-(三氟甲基)-4-吡啶基的那些。最优选的具有化学式(Id)的化合物是其中 R_{13} 是氢的那些。

[0107] 尤其优选的具有化学式(Id)的化合物是其中 R_2 是氢并且 R_1 是氰基的那些。在具有化学式(Id)的化合物的进一步优选的组中, R_1 是三氟甲基。

[0108] 在具有化学式(Id)的化合物的更优选的组中, G_2 是氮或次甲基并且 Y 是氮或次甲基。尤其优选的具有化学式(Id)的化合物是其中 G_2 是次甲基的那些。

[0109] 在具有化学式(Id)的化合物的高度优选的组中, V 是氮并且 m 是2。

[0110] 在另一组优选的具有化学式(Id)的化合物中, V 是 CH 。

[0111] 在具有化学式I的化合物的尤其优选的实施例中,

[0112] R_1 是氢或氰基;

[0113] R_2 是氢;

[0114] R_3 是 C_1-C_4 烷基;

[0115] R_4 是氢;

[0116] R_5 是 C_1-C_4 卤代烷基;

[0117] R_6 是氢;

[0118] p 是1;

[0119] n是1或2;

[0120] m是0或2;优选2;

[0121] X是CH;

[0122] Y是N;

[0123] Z是碳;

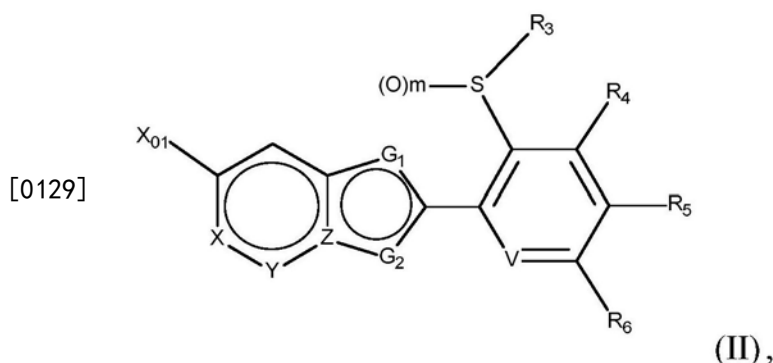
[0124] G₁是N;

[0125] G₂是N-R₇;

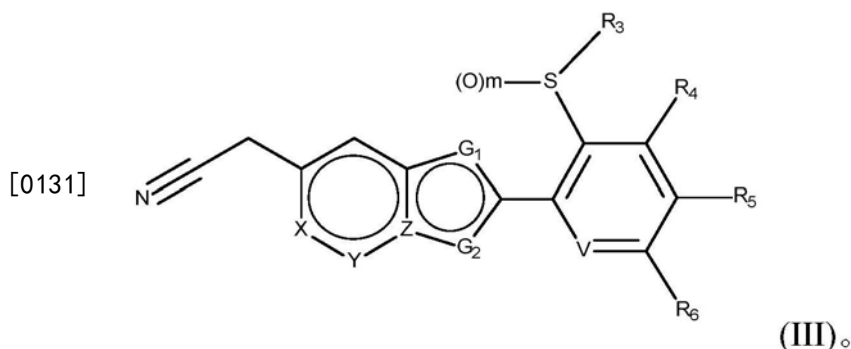
[0126] R₇是C₁-C₄烷基;并且

[0127] V是N。

[0128] 根据本发明的用于制备具有化学式 (I) 的化合物的工艺原则上通过本领域普通技术人员已知的方法来进行。更具体地,可以通过具有化学式 (II) 的化合物

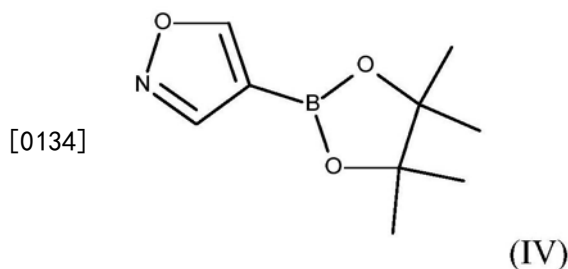


[0130] (其中X、Y、Z、G₁、G₂、R₃、R₄、R₅、R₆、m和V是上文在化学式 (I) 下所描述的,并且X₀₁是卤素或三氟甲磺酸酯基团) 与乙腈阴离子等价物的过渡金属催化的偶联来制备具有化学式 (I) 的化合物(其中R₁是氰基),以给出具有化学式 (III) 的化合物。

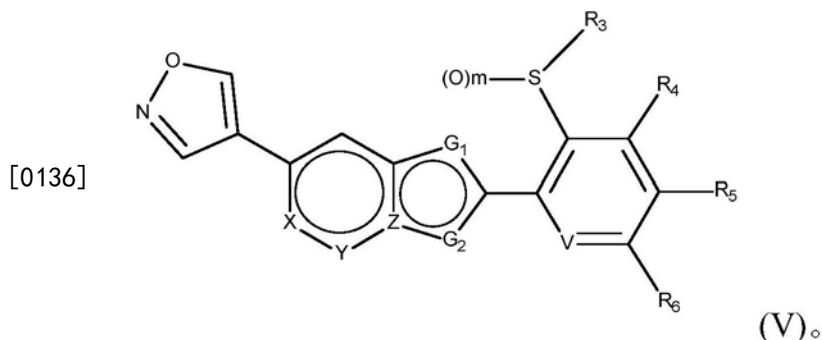


[0132] 在这些反应中,可以使用各种各样的乙腈阴离子等价物。这类实例是三-正丁基甲锡烷基乙腈,其可以在如由密迪噶 (Mitiga) 等人 (化学快报 (Chem. Lett.) 1984, 1511) 描述的施蒂勒反应条件下与具有化学式 (II) 的化合物偶联,或在钯催化剂 (例如三 (二苯亚甲基丙酮) 二钯 (0)) 和配体 (例如 Xantphos 或 P (t-Bu)₃)、氟化物源 (例如 ZnF₂) 的存在下,在偶极非质子溶剂 (例如 DMF) 中,在 80°C-120°C 之间的温度下与三甲基甲硅烷基乙腈偶联。这些反应在文献中有很好的先例,例如参见哈特韦 (Hartwig) 等人 (美国化学会志 (J. Am. Chem. Soc.) 2002, 124, 9330 和美国化学会志 2005, 127, 15824)。

[0133] 可替代地,具有化学式 (III) 的化合物可通过具有化学式 (II) 的化合物与具有化学式 (IV) 的硼酸的铃木反应进行制备;

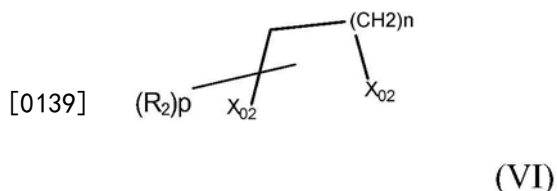


[0135] 在碱(例如氟化钾或碳酸铯)、钯催化剂(例如[1,1'-双(二苯基磷基)二茂铁]二氯化钯(II))和极性非质子溶剂(例如DMSO或DMF)的存在下,在80°C-150°C之间的温度下。反应至具有化学式(II)的化合物通过具有化学式(V)的中间体进行

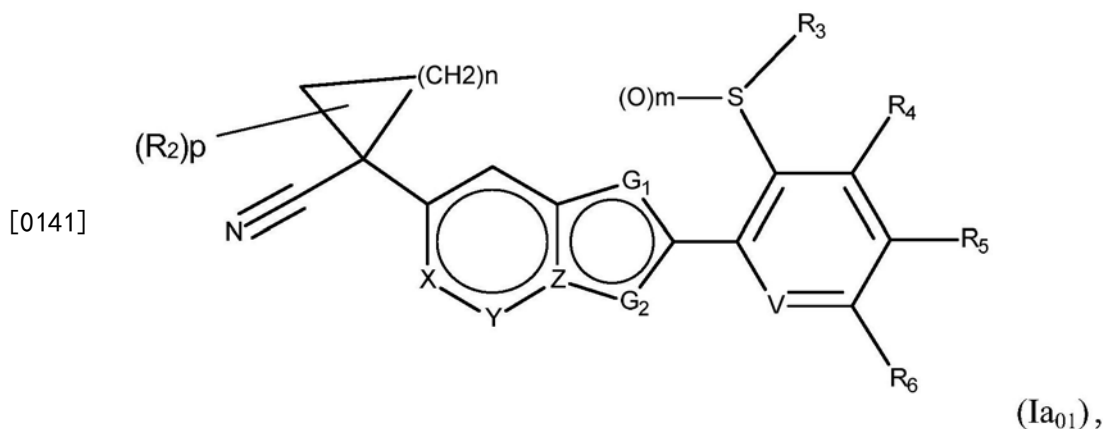


[0137] 中间体(V)可以按一锅法直接转化为具有化学式(III)的化合物,或经过分离并按单独步骤通过用适合的碱(例如氟化钾或碳酸铯)处理转化为具有化学式(III)的化合物。这些反应在文献中是熟知的并描述在美国化学会志 2011,133,6948-6951中。

[0138] 在碱(例如氢化钠)的存在下、在惰性溶剂(例如DMF或碳酸铯)中,在非质子溶剂(例如丙酮或乙腈)中,在具有化学式(VI)的化合物(其中R₂、p和n是如先前所定义的,并且X₀₂是离去基团(例如卤素或三氟甲磺酸酯))的存在下,处理具有化学式(III)的化合物;

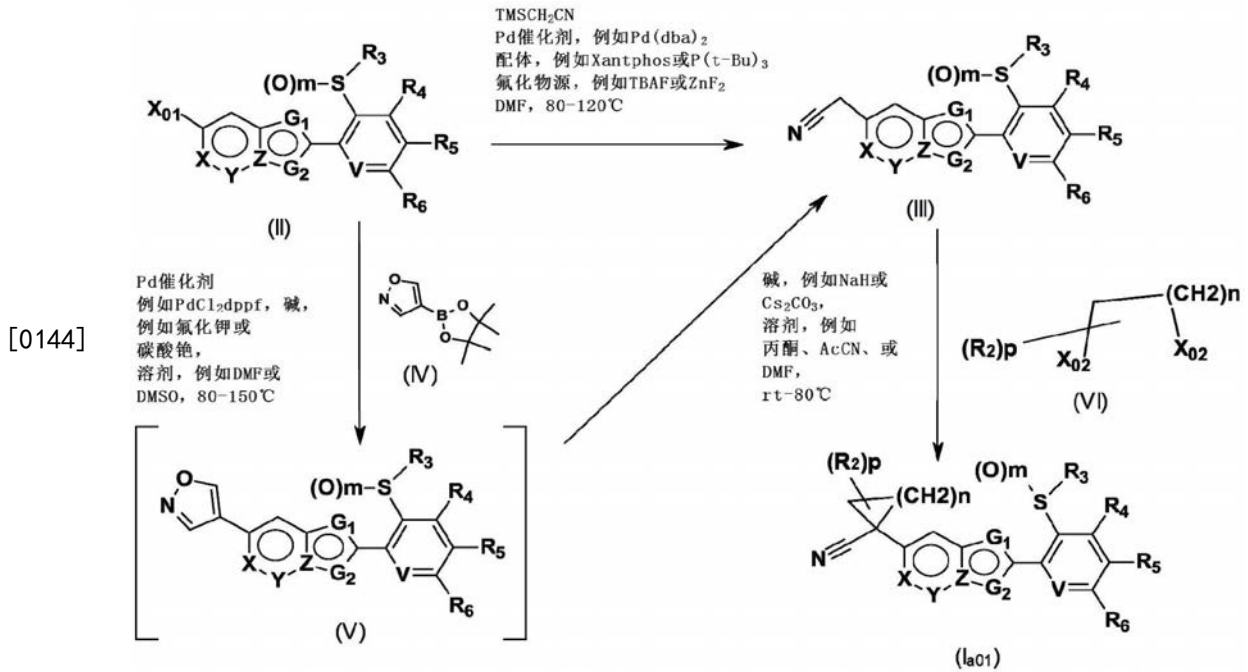


[0140] 以给出具有化学式(Ia₀₁)的化合物



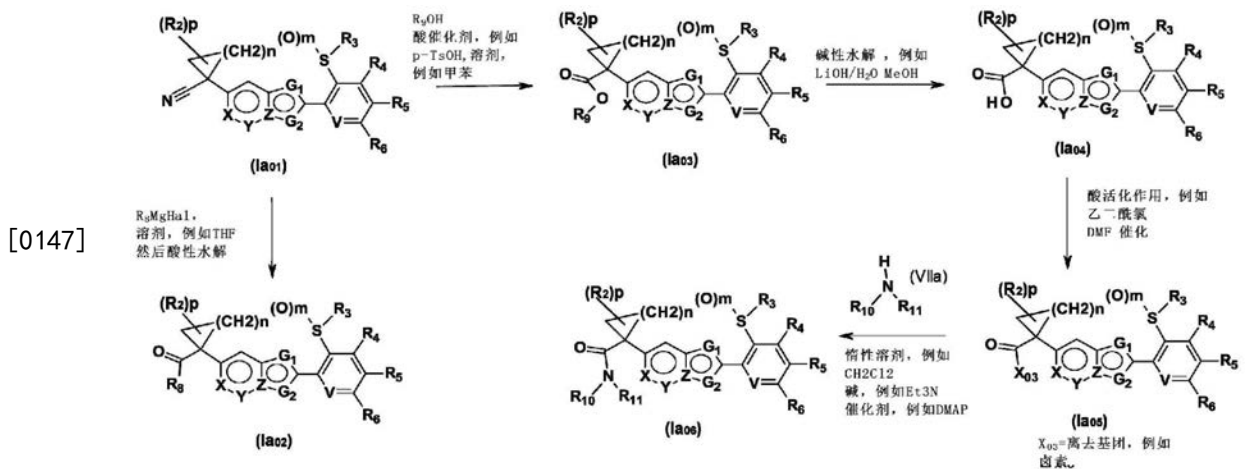
[0142] 其中R₂、p、n、m、R₃、R₄、R₅、R₆、X、Y、Z、V、G₁和G₂是如在化学式(I)中所描述的。方案1中概括了该化学过程。

[0143] 方案1



[0145] 通过本领域技术人员已知并在方案2中描述的方法,具有化学式 (Ia₀₁) 的化合物可以转化为具有化学式 (I) 的化合物 (其中R₁是C(O)R₈、C(O)OR₉、CONR₁₀R₁₁)。

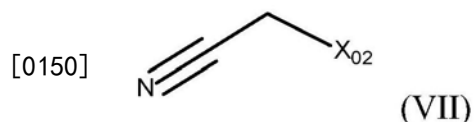
[0146] 方案2



[0148] 在方案2中,可以用具有化学式R₈MgHal的格式试剂处理具有化学式 (Ia₀₁) 的化合物 (其中R₂、p、n、m、R₃、R₄、R₅、R₆、X、Y、Z、V、G₁和 G₂是如在化学式 (I) 中所描述的), 随后进行酸性水解 (如在C. 费里 (C. Ferri), “有机合成反应 (Reaktionen der Organischen Synthese)” Georg Thieme Verlag, 斯图加特市, 1978, 第324页ff中描述的), 以给出具有化学式 (Ia₀₂) 的化合物 (并且其中R₈是如在化学式 (I) 中所定义的)。通过本领域技术人员已知的方法, 例如通过用碱性的碱 (例如氢氧化锂) 处理, 在水中以及水混溶性溶剂 (例如甲醇或丙酮) 中可以将具有化学式 (Ia₀₃) 的化合物容易地水解为具有化学式 (Ia₀₄) 的相应的酸。通过本领域普通技术人员已知以及描述于例如化学会志综述 (Chem. Soc. Rev.), 2009, 38, 606-631中的方法, 可以将 (Ia₀₄) 的化合物活化为具有化学式 (Ia₀₅) 的化合物 (其中 (X₀₃) 是离去基团 (例如卤素)) 或混合酸酐。随后在碱 (例如三乙胺) 和催化剂 (例如DMAP) 的存在下,

在惰性溶剂(例如二氯甲烷)中,用具有化学式(VIIa)的化合物处理具有化学式(Ia05)的化合物以产生具有化学式(Ia06)的化合物。

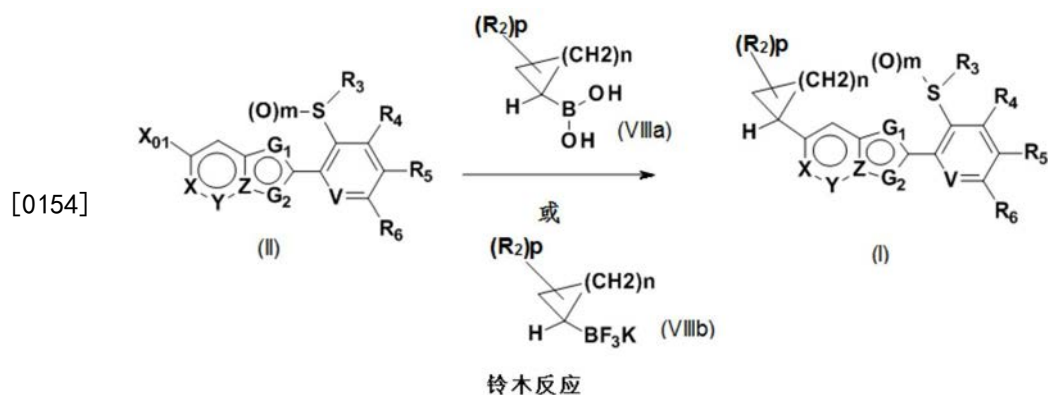
[0149] 可替代地,可以通过将锌插入C-X₀₁键中(例如通过在惰性溶剂(例如 THF或二乙基醚)中用活化的锌金属进行处理,或通过相应的锂或镁试剂的金属交换反应(transmetallation))从具有化学式(II)的化合物获得具有化学式(III)的化合物。从卤素制备有机锌试剂是本领域技术人员所熟知的,并且已经由例如Knochel等人在化学综述(Chem.Rev.)1993,93,2117中进行了描述。随后将有机锌试剂与具有化学式(VII)的化合物(其中X₀₂是卤素(优选溴))在催化剂(例如Ni(acac)₂)



[0151] 和膦配体(例如环己基二苯基膦)的存在下,在惰性溶剂(例如四氢呋喃)中反应,以产生具有化学式(III)的化合物。此类化学过程已在文献中进行了描述(参见合成(Synthesis),1987,40-42)。如在方案1和方案2中所描述的,将具有化学式(III)的化合物转化为具有化学式(I)的化合物。

[0152] 通过本领域技术人员已知以及描述于例如四面体快报(Tetrahedron Letters)43,6987,2002或W0 2014/025736中的方法,可以通过将具有化学式(II)的化合物与具有化学式(VIIIa)的硼酸或具有化学式(VIIIb)的摩兰德(Moillander)盐的直接铃木偶联来制备具有化学式(I)的化合物(其中R₁是H)。

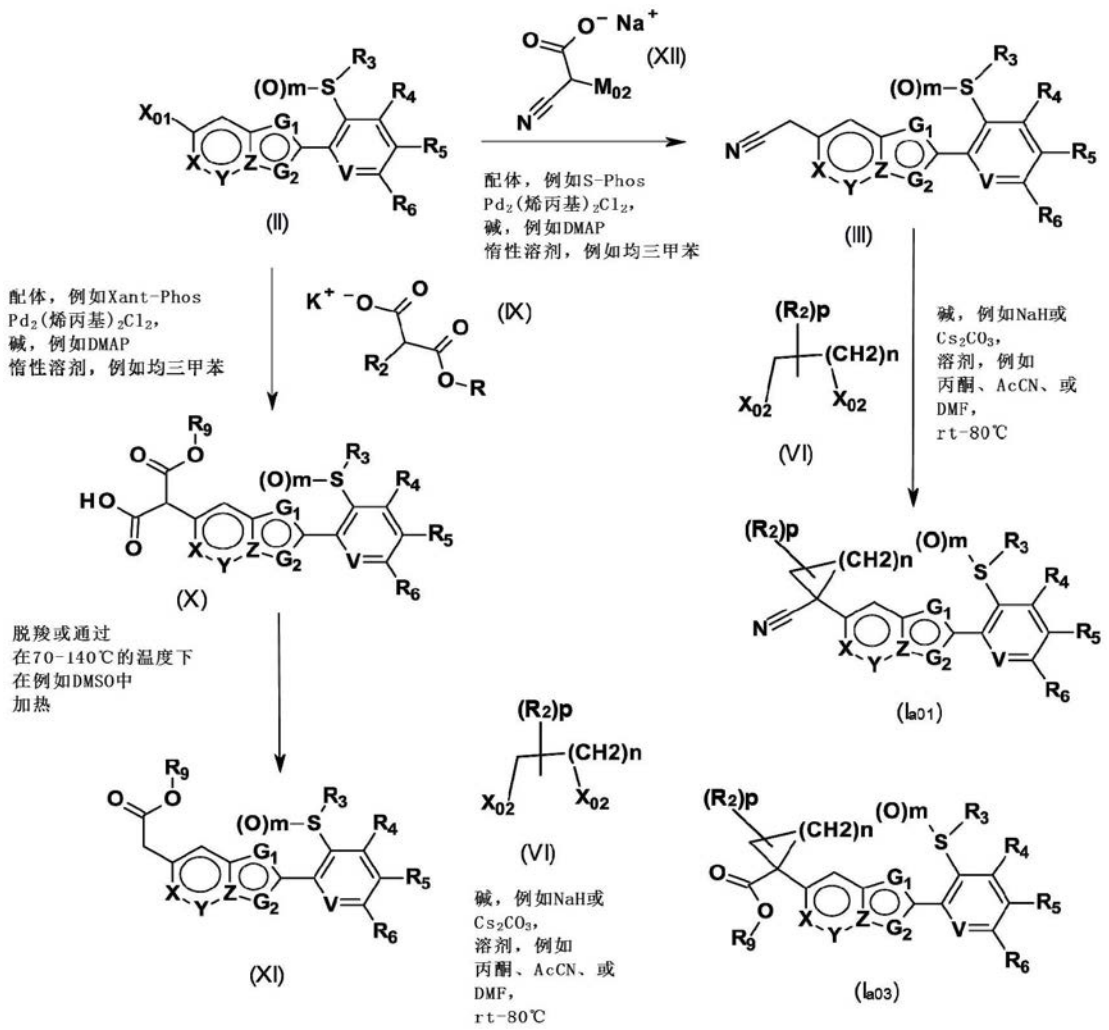
[0153] 方案3:

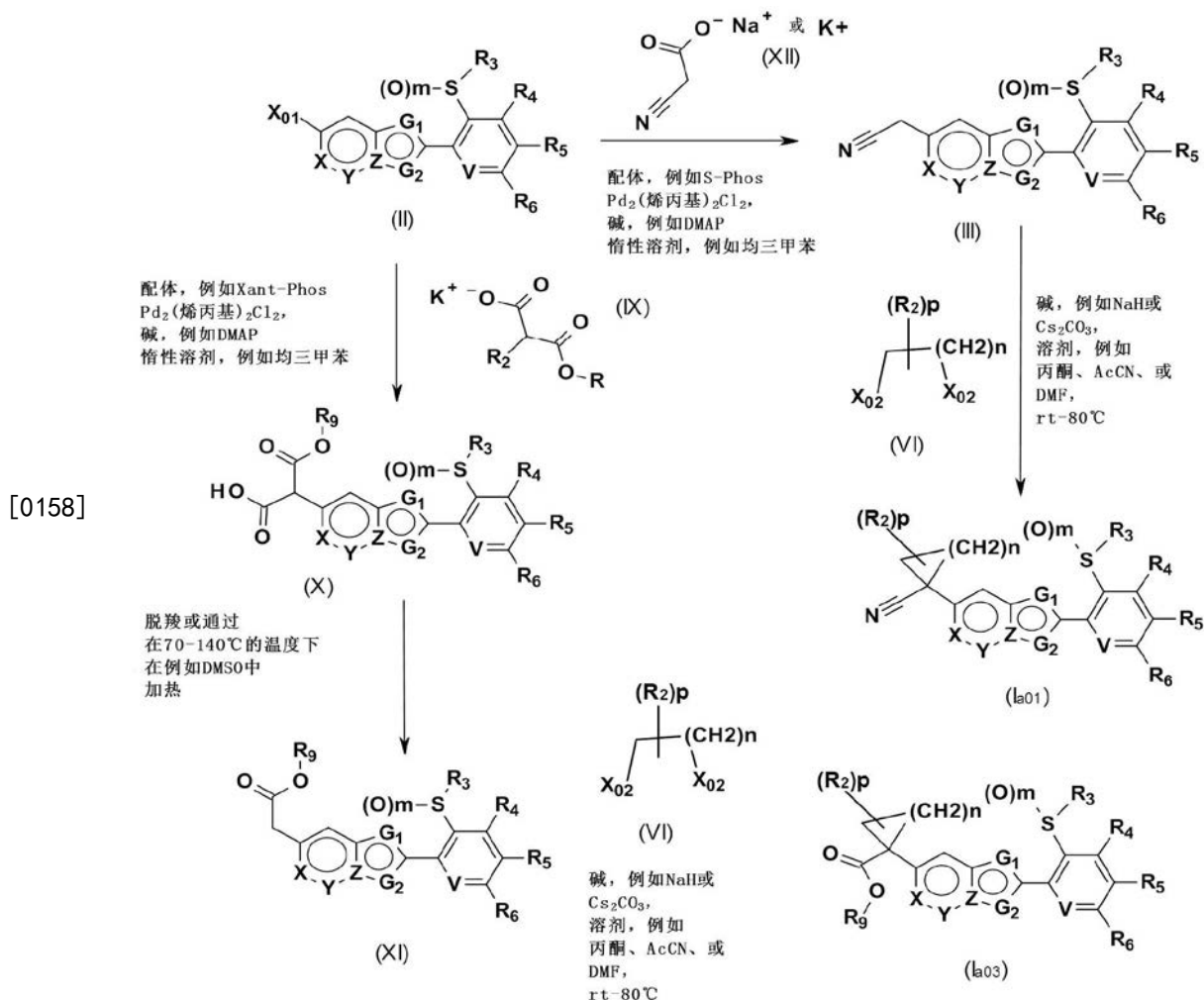


[0155] 具有化学式(I)的化合物的另外的方法在方案4中进行了描述。

[0156] 方案4:

[0157]

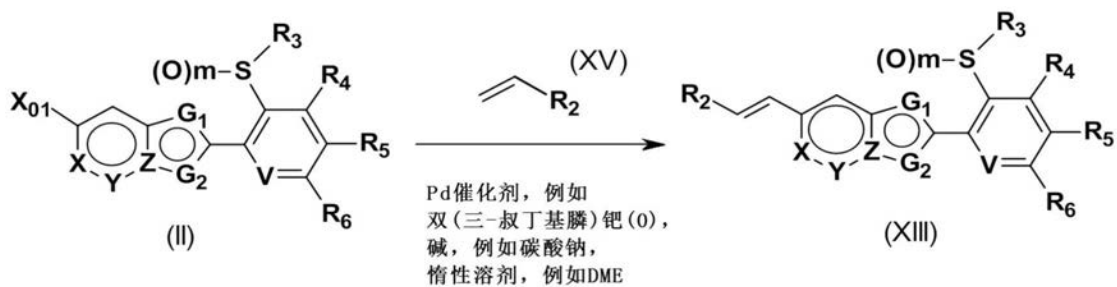




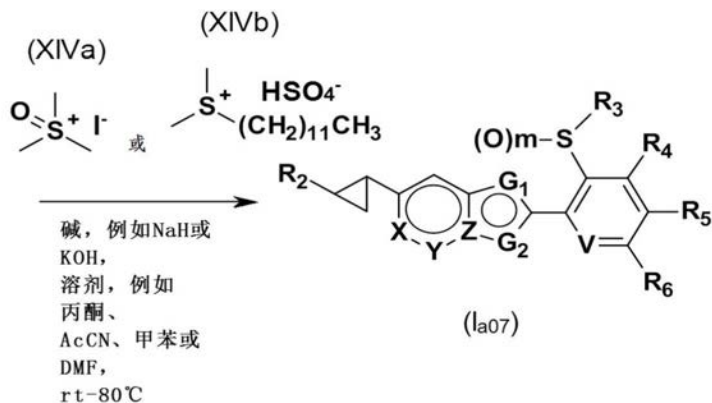
[0159] 如在方案4中所示,在配体(例如Xant-Phos)、适合的钯催化剂(例如 Pd₂(烯丙基)₂Cl₂)和碱(例如DMAP)、惰性溶剂(例如均三甲苯)的存在下,将具有化学式(II)的化合物与具有化学式(IX)的化合物交叉偶联(如描述在例如Y.S.峰(Y.S.Feng)等人,四面体(Tetrahedron),2012,68, 2113中),以给出具有化学式(X)的化合物(其中G₁、G₂、R₃、R₄、R₅、R₆、R₉、m、V、X、Y和Z具有上文化学式I下所描述的含义)。可以分离化合物(X)或其可以自发地脱羧基,或通过惰性溶剂(例如DMSO)中加热以给出具有化学式(XI)的化合物。随后转化为具有化学式(Ia03)的化合物,这可以如先前所述实现并在方案4中示出。可替代地,在非常类似的条件下,可以将具有化学式(II)的化合物与具有化学式(XII)的化合物进行脱羧基交叉偶联,以给出具有化学式(III)的化合物。将具有化学式(III)的化合物转化为具有化学式(Ia01)的化合物先前已经描述过(方案1)。已经在类似地情况下描述了钯催化的脱羧基交叉偶联,例如在R.尚(R.Shang)等人,应用化学国际版本(Angew.Chem.Int.Ed.),2011,50,4470中。

[0160] 具有化学式(Ia07)的化合物(其中n是1,p是1,R₁是H,R₂、R₃、R₄、R₅、R₆、X、Y、Z、G₁、G₂、V和m是如在化学式(I)中所描述的)也可以按如方案5中所示进行制备。

[0161] 方案5



[0162]

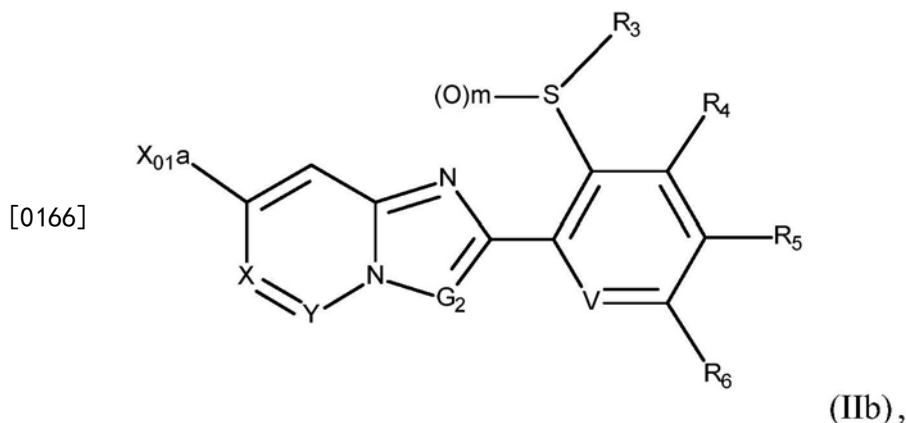


[0163] 在方案6中,在典型的赫克(Heck)条件下(例如本领域技术人员已知以及描述在例如化学综述(Chem.Rev.)2000,100,3009-3066中的那些),使具有化学式(II)的化合物与具有化学式(XV)的化合物反应。在惰性溶剂(例如DMF或甲苯)中,可以将获得的具有化学式(XIII)的化合物用具有化学式(XIVa)或(XIVb)的化合物和碱(例如碱金属氢化物(例如氢氧化钠)或碱金属醇盐(例如氢氧化钾))处理,以给出具有化学式(Ia07)的化合物(例如R₁、X、Y、Z、G₁、G₂、V、R₂、R₄、R₅、R₆、R₃和m具有如针对化学式(I)所定义的含义)。类似的化学过程已经描述在文献中,例如在四面体(Tetrahedron),第43卷,第12期,1987,第2609-2651页中。

[0164] 用于制备具有化学式(I)的化合物的所需起始材料(即具有化学式(II)的化合物)在很多情况下是已知的,并且描述在文献[化学文摘参考号(Chemical abstract reference numbers)]中;6-溴-2-(3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-7-异丙基-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶[1421956-60-6]、6-溴-7-(二氟甲基)-2-(3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶[1421956-59-3]、6-溴-7-(二氟甲基)-2-(3-乙基亚磺酰基-2-吡啶基)-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶[1421956-58-2]、6-溴-7-(二氟甲基)-2-(3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶[1421956-57-1]、2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-6-碘-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶[1421956-26-4]、6-溴-2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶[1421956-07-1]、6-溴-2-[3-乙基亚磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶[1421956-06-0]、6-溴-2-[3-乙基硫烷基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶[1421956-04-8]、6-溴-2-(3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶-7-甲醛[1421954-62-2]、6-溴-2-(3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶[1421954-25-7]、2-(3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-6-碘-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶[1421950-96-0]、2-[3-乙基硫烷基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-5-碘-1-甲基-苯并咪唑[1421950-48-2]、2-(3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-5-碘-1-甲基-苯并咪唑[1421950-16-4]。2-[3-乙基硫烷基-5-(三氟甲

基)-2-吡啶基]-5-碘-1,3-苯并噁唑[1616682-41-7]、2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-5-碘-1,3-苯并噁唑[1616682-43-9]、6-溴-2-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)噁唑并[5,4-b]吡啶[1616682-28-0]、6-溴-2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]噁唑并[5,4-b]吡啶[1616682-16-6]、5-溴-2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-1,3-苯并噁唑[1616682-19-9]、2-[3-乙基硫烷基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-6-碘-噁唑并[5,4-b]吡啶[1421956-35-5]和2-[2-乙基硫烷基-4-(三氟甲基)苯基]-6-碘-噁唑并[5,4-b]吡啶[1383947-33-8]。

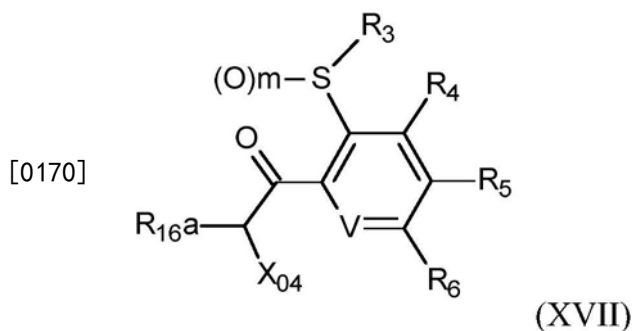
[0165] 其他具有化学式 (IIb) 的中间体



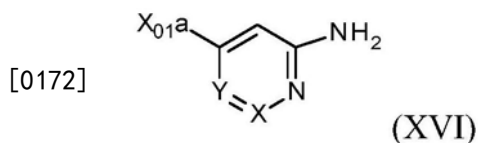
[0167] (其中G₂、R₃、R₄、R₅、R₆、m、V、X和Y具有如上文在化学式 (I) 下所描述的定义,并且X_{01a}是卤素) 是新颖的并且是为了制备具有化学式 (I) 化合物而特别研发的。因此,它们也形成本发明的主题的一部分。

[0168] 对于上文提及的化学式 I、Ia、Ib、Ic 和 Id 的优选的取代基定义也适用于优选的具有化学式 II 的化合物。

[0169] 在惰性溶剂中,任选地适合的碱的存在下,新颖的具有化学式 (IIb) 的化合物(其中G₂、R₃、R₄、R₅、R₆、m、V、X和Y具有如先前描述的定义,并且X_{01a}是卤素)的合成可以通过用具有化学式 (XVII) 的化合物

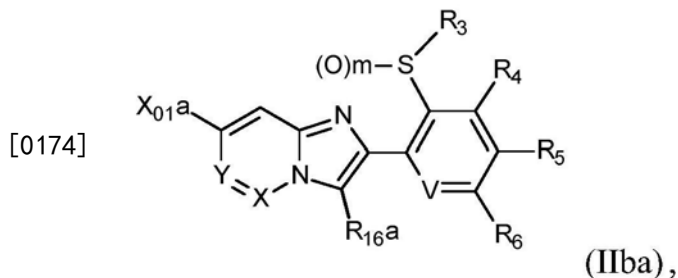


[0171] (其中X₀₄是卤素,并且R₄、R₅、R₆、R₃和m具有对于化学式 (I) 所描述的定义,并且R_{16a}是氢或C₁-C₄烷基) 处理具有化学式 (XVI) 的化合物



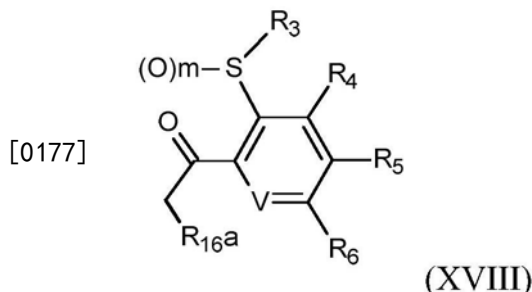
[0173] (其中Y、X是如在化学式 (I) 中所描述的并且X_{01a}是卤素) 来进行制备,以给出具有

化学式 (IIba) 的化合物。



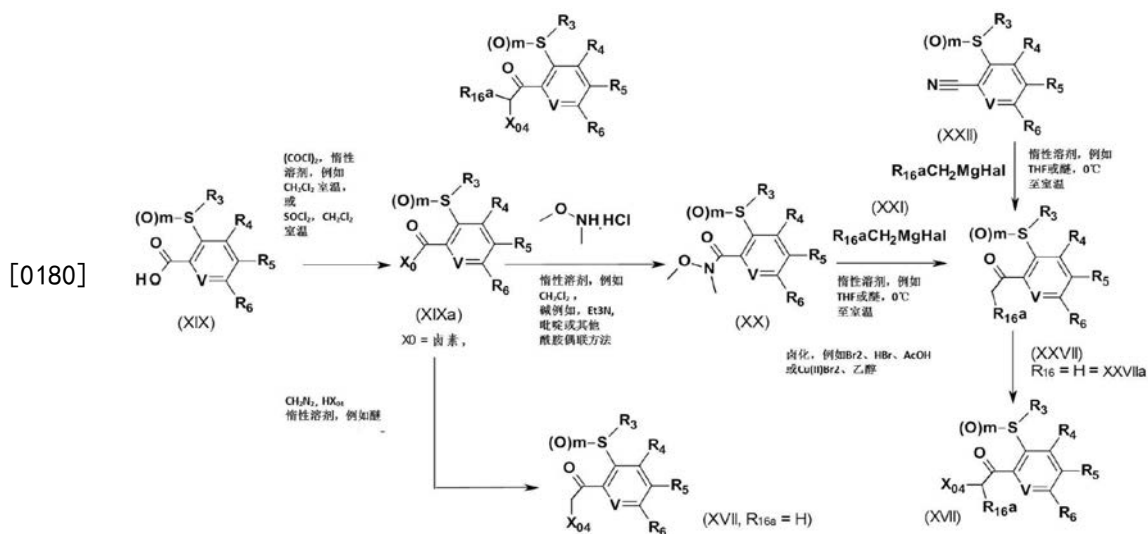
[0175] 其中Y、X、X_{01a}、V、R₃、R₄、R₅和R₆是如在化学式 (I) 中所描述的并且R_{16a}是氢或C₁-C₄烷基。这些反应在文献中有很好的先例 (例如参见W0 2013191113或药物研究文献 (Archiv.Pharm.Res.), 37 (5), 588-599; 2014), 并且通常在惰性溶剂 (例如乙醇或DMF)、在60°C-160°C之间的温度、任选地在碱的存在下进行。

[0176] 制备具有化学式 (IIb) 的化合物的一种另外的方法涉及使具有化学式 (XIII) 的化合物与 (XVIII) 的化合物



[0178] 在路易斯酸 (例如碘化锌 (II) 或三氟甲烷磺酸铜 (III)) 的存在下, 在惰性溶剂 (例如氯苯或1,2,二氯苯) 中, 与催化的铜 (II) 盐 (例如乙酸Cu (II)), 在氧或大气气氛下, 在100°C-180°C之间的温度 (优选110°C-140°C) 下发生反应, 以给出具有化学式 (IIba) 的化合物 (其中R_{16a}是氢)。先前已经在文献 (参见高级合成与催化 (Adv.Synth.Catal.) 2013, 355, 1741-1747, 以及有机化学杂志 (J.Org.Chem.), 2013, 78, 12494-12504, 当R_{16a}是氢时) 中描述了这类反应。具有化学式 (XVII) 和 (XVIII) 的化合物可从具有化学式 (XIX) 的化合物通过例如在方案6中所示的方法制备。

[0179] 方案6

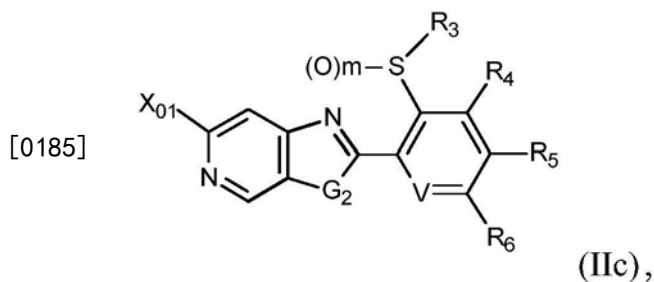


[0181] 在方案6中,通过本领域的普通技术人员所知的并描述于例如C.费里 (Ferri),“有机合成反应(Reaktionen der Organischen Synthese)”,Georg Thieme Verlag,斯图加特市,1978,第223页ff中的方法,在与N,0-二甲基羟基胺反应时,具有化学式(XIXa)的酰基卤被转化为魏因雷布(Weinreb)酰胺(XX)。然后,根据魏因雷布(Weinreb)的方法(四面体快报(Tetrahedron Letters)1981,22,3815-3818),使具有化学式(XX)的魏因雷布(Weinreb)酰胺与具有化学式 $R_{16a}CH_2MgHal$ (XXI)的格氏试剂反应,以给出具有化学式XXVII和XXVIIa的化合物。具有化学式XXVII和XXVIIa的化合物还可通过用具有化学式 $R_{16a}CH_2MgHal$ 的格氏试剂处理具有化学式XXII的腈化合物,随后进行酸性水解(如在C.费里(Ferri),“有机合成反应(Reaktionen der Organischen Synthese)”,Georg Thieme Verlag,斯图加特市,1978,第223页ff中所述的)来制备。

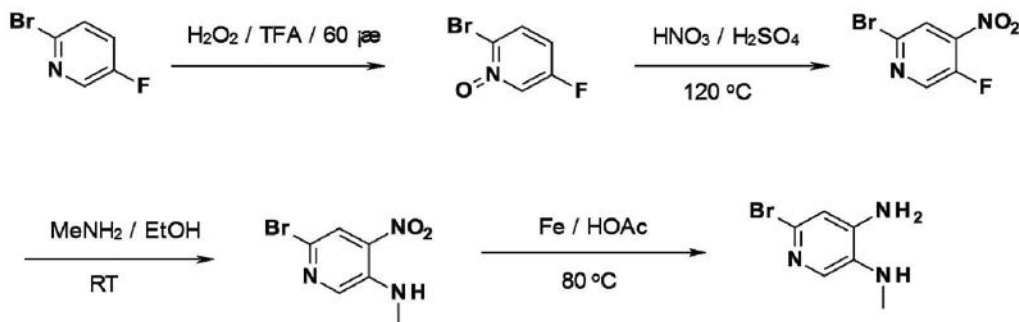
[0182] 可以用例如溴和氢溴酸在乙酸中的混合物(如在磷、硫和硅及相关元素(Phosphorus,Sulfur and Silicon and the Related Elements),2013,188(12),1835-1844中所述的)或用例如溴化铜(II),在惰性溶剂(例如氯仿、乙酸乙酯等等)(如在药物化学杂志(J.Med.Chem.),2013,56(1),84-96中所述的)中将具有化学式XXVII和XXVIIa的化合物卤化为具有化学式XVII的化合物。可替代地,具有化学式XVII的化合物(其中 R_{16a} 是氢)可通过在惰性溶剂中(例如二乙醚),用重氮甲烷或三甲基硅烷基重氮甲烷处理并且随后用氢卤酸(例如氢溴酸或盐酸)处理,直接从具有化学式XIXa的化合物中制备。这类程序在文献中是众所周知的,例如参见欧洲药物化学杂志(Eu.J. Med.Chem.),1987,22(5),457-62和WO 2009010455。

[0183] 具有化学式XVI的化合物在文献中通常是已知的,例如(括号中为CAS索引号);4-溴吡啶-2-胺[84249-14-9]、5-溴哒嗪-3-胺[1187237-00-8]和6-溴嘧啶-4-胺[1159818-57-1]。在本发明中使用的具有化学式(XIX)的化合物通常是已知的并且已描述在WO 12/086848、WO 13/018928、WO 12/086848、WO 2013/187422、WO 2013/191113和WO 2013/191188中。

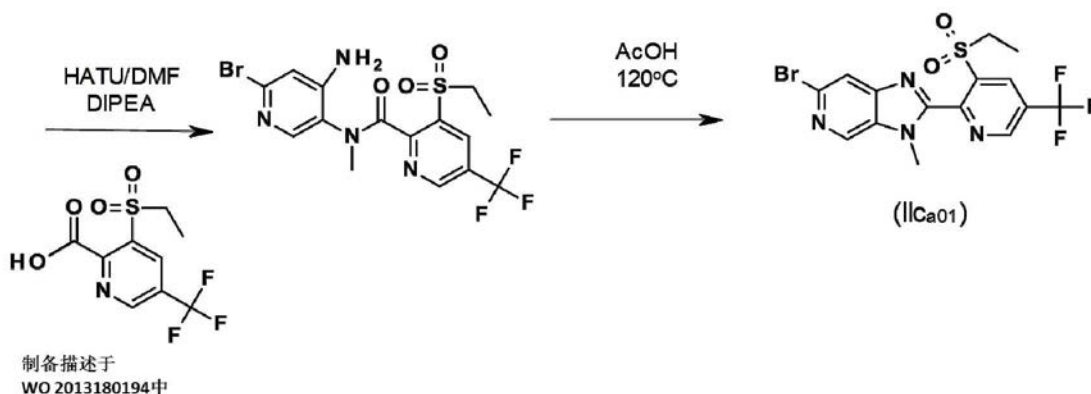
[0184] 具有化学式(IIc)的化合物



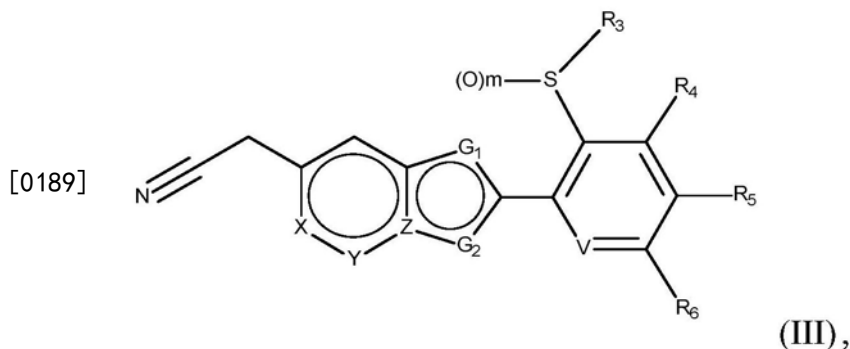
[0186] 可以按例如如方案7中针对具有化学式(IIc_{a01})的代表性实例化合物所示的进行制备:



[0187]



[0188] 具有化学式 (III) 的中间体,



[0190] (其中 G_1 、 G_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 m 、 V 、 X 、 Z 和 Y 具有如上文在化学式(I)下所描述的定义)是新颖的并且是为了制备具有化学式(I)化合物而特别研发的。因此,它们也形成本发明的主题的一部分。对于上文提及的化学式I、Ia、Ib、Ic和Id的优选的取代基定义也适用于优选的具有化学式III的化合物。

[0191] 这些反应物可以在碱的存在下发生反应。适合的碱的实例是碱金属或碱土金属氢氧化物、碱金属或碱土金属氢化物、碱金属或碱土金属酰胺、碱金属或碱土金属醇盐、碱金属或碱土金属乙酸盐、碱金属或碱土金属碳酸盐、碱金属或碱土金属二烷基酰胺或碱金属或碱土金属烷基甲硅烷基酰胺、烷基胺、亚烷基二胺、游离的或 N -烷基化的饱和或不饱和的环烷基胺、碱性杂环、氢氧化铵以及碳环胺。可以提及的实例是氢氧化钠、氢化钠、氨基钠、甲醇钠、乙酸钠、碳酸钠、叔丁醇钾、氢氧化钾、碳酸钾、氢化钾、二异丙基锂、双(三甲基甲硅烷基)氨基钾、氢化钙、三乙胺、二异丙基乙胺、三亚乙基二胺、环己胺、 N -环己基- N,N -二甲胺、 N,N -二乙苯胺、吡啶、4-(N,N -二甲氨基)吡啶、奎宁环、 N -甲基吗啉、苄基三甲基氢氧化铵以及1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一-7-烯(DBU)。

[0192] 这些反应物能按照原样彼此进行反应,即不用添加溶剂或稀释剂。然而,在大多数

情况下,加入惰性溶剂或稀释剂或这些的混合物是有利的。如果该反应在碱的存在下进行,那么这些过量使用的碱(如三乙胺、吡啶、N-甲基吗啉或N,N-二乙苯胺)还可以充当溶剂或稀释剂。

[0193] 该反应有利地在从约-80°C到约+140°C,优选从约-30°C到约+100°C的温度范围,在许多情况下在介于环境温度与约+80°C之间的范围下进行。

[0194] 具有化学式(I)的化合物能以本身已知的方法转化为另一种具有化学式(I)的化合物,这是通过以常规方式将具有化学式(I)的该起始化合物的一个或多个取代基用根据本发明的另一个或其他的一个或多个取代基的替代来实现的。

[0195] 取决于在每种情况下适合的反应条件和起始材料的选择,有可能的是例如,在一个反应步骤中仅将一个取代基用根据本发明的另一个取代基替代,或者在同一个反应步骤中可以将多个取代基用多个根据本发明的其他取代基来替代。

[0196] 具有化学式(I)的这些化合物的盐能以本身已知的方式进行制备。因此,例如,具有化学式(I)的化合物的酸加成盐是通过用适合的酸或合适的离子交换试剂进行处理来获得的,并且与碱的盐是通过用适合的碱或用合适的离子交换试剂进行处理来获得的。

[0197] 具有化学式(I)的化合物的盐能以常规方式转化为游离的化合物(I)、酸加成盐(例如通过用合适的碱性化合物或用合适的离子交换试剂进行处理)以及碱盐(例如通过用合适的酸或用合适的离子交换试剂进行处理)。

[0198] 具有化学式(I)的化合物的盐能以本身已知的方式转化为具有化学式(I)的化合物的其他盐、酸加成盐,例如转变成为其他酸加成盐,例如通过在合适的溶剂中用酸的合适的金属盐(如钠盐、钡盐或银盐,例如用乙酸银)来处理无机酸的盐(如盐酸盐),在该溶剂中,所形成的无机盐(例如氯化银)是不溶的并且因此从该反应混合物中沉淀出。

[0199] 取决于程序或反应条件,具有成盐特性的具有化学式(I)的化合物能以游离形式或以盐的形式获得。

[0200] 根据分子中存在的不对称碳原子的数目、绝对和相对构型和/或根据分子中存在的非芳香族双键的构型,在每种情况下为游离形式或为盐形式的具有化学式(I)的化合物和适当时其互变异构体可以可能的异构体之一的形式或作为其混合物存在,例如以纯异构体的形式,如对映体和/或非对映体,或作为异构体混合物,如对映异构体混合物,例如外消旋体、非对映体混合物或外消旋体混合物存在;本发明涉及纯异构体以及所有可能的异构体混合物,并且在上文和下文中都应如此理解,即使立体化学细节未在所有情况下明确提及。

[0201] 处于游离形式或处于盐形式的具有化学式(I)的化合物的非对映异构体混合物或外消旋体混合物(它们的获得可以取决于已选定的起始材料和程序)能够在这些组分的物理化学差异的基础上,例如通过分步结晶、蒸馏和/或层析法以已知的方式分离成纯的非对映异构体或外消旋体。

[0202] 能够以类似方式获得的对映异构体混合物(如外消旋体)可以通过已知方法拆分成光学对映体,例如通过从光学活性溶剂再结晶;通过在手性吸附剂上的层析法,例如在乙酰纤维素上的高效液相层析法(HPLC);借助于合适的微生物,通过用特异性固定酶裂解;通过形成包括化合物,例如使用手性冠醚,其中仅一个对映异构体被络合;或通过转化成非对映异构盐,例如通过使碱性最终产物外消旋体与光学活性酸(如羧酸,例如樟脑、酒石酸或

苹果酸或磺酸,例如樟脑磺酸)反应,并且分离能够以此方式获得的非对映异构体混合物,例如基于其不同溶解度通过分步结晶,从而给出非对映异构体,从这些非对映异构体可以通过合适的试剂(例如碱性试剂)的作用使所希望的对映异构体变成游离。

[0203] 纯的非对映异构体或对映异构体可以根据本发明来获得,不仅是通过分离合适的异构体混合物,还可以是通过普遍已知的非对映选择性或对映选择性合成的方法,例如通过利用具有合适的立体化学的起始材料进行根据本发明的方法。

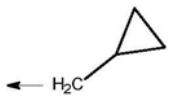
[0204] 可以通过使具有化学式(I)的化合物与适合的氧化剂(例如 H_2O_2 /尿素加合物)在酸酐(例如三氟乙酸酐)的存在下进行反应来制备N-氧化物。此类氧化从文献,例如从药物化学杂志(J. Med. Chem.), 32(12), 2561-73, 1989或W0 00/15615中已知。

[0205] 如果这些单独的组分具有不同的生物活性,那么有利的是在每种情况下分离或合成在生物学上更有效的异构体,例如对映异构体或非对映异构体,或者异构体混合物,例如对映异构体混合物或非对映异构体混合物。

[0206] 具有化学式(I)的化合物和适当时其互变异构体(在每种情况下处于游离形式或处于盐形式)如果适当的话还能以水合物的形式获得和/或包括其他溶剂,例如可以用于使以固体形式存在的化合物结晶的那些。

[0207] 根据以下组 1到11的这些化合物可以根据上述的这些方法来制备。随后的这些实例旨在说明本发明并且展示优选的具有化学式(I)的化合物。

[0208] 表X:该表披露了对于化学式(Iaa)、(Iab)、(Iac)、(Iad)、(Iae)和(Iaf)的 27个取代基指定为X.001至X.027,这些化学式在表X之后披露。在表X 中,Et代表 CH_2CH_3 , CH_2Cyp 代表

[0209]  其中箭头代表附接至硫的点。

[0210] 表X

[0211]

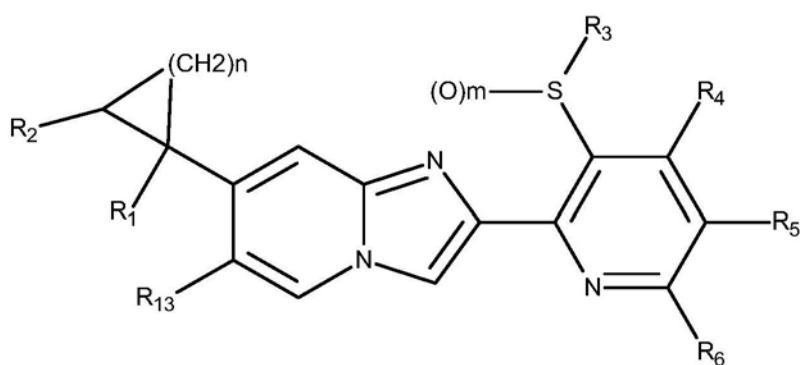
化合物 编号	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆	R ₁₃
X.001	H	H	Et	H	CF ₃	H	H
X.002	CN	H	Et	H	CF ₃	H	H
X.003	H	H	Et	H	H	H	H
X.004	CN	H	Et	H	H	H	H
X.005	H	H	Et	H	OCHF ₂	H	H
X.006	CN	H	Et	H	OCHF ₂	H	H
X.007	H	CN	Et	H	CF ₃	H	H
X.008	H	CN	Et	H	H	H	H
X.009	H	H	CH ₂ Cyp	H	CF ₃	H	H
X.010	CN	H	CH ₂ Cyp	H	CF ₃	H	H

[0212]

化合物 编号	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆	R ₁₃
X.011	H	H	CH ₂ Cyp	H	H	H	H
X.012	CN	H	CH ₂ Cyp	H	H	H	H
X.013	H	H	CH ₂ Cyp	H	OCHF ₂	H	H
X.014	CN	H	CH ₂ Cyp	H	OCHF ₂	H	H
X.015	H	CF ₃	Et	H	OCHF ₂	H	H
X.016	CF ₃	H	Et	H	OCHF ₂	H	H
X.017	H	CF ₃	Et	H	CF ₃	H	H
X.018	CF ₃	H	Et	H	CF ₃	H	H
X.019	H	CF ₃	Et	H	H	H	H
X.020	CF ₃	H	Et	H	H	H	H
X.021	CN	H	Et	H	4-(三氟甲基)苯基	H	H
X.022	CN	H	Et	H	5-氯-2-嘧啶基	H	H
X.023	CN	H	Et	H	4-氯苯基	H	H
X.024	CN	H	Et	H	2-嘧啶基	H	H
X.025	CN	H	Et	H	CF ₃	H	4-(三氟甲基)- 2-吡啶基
X.026	CN	H	Et	H	CF ₃	H	5-(三氟甲基)- 3-吡啶基
X.027	CN	H	Et	H	CF ₃	H	2-(三氟甲基)- 4-吡啶基

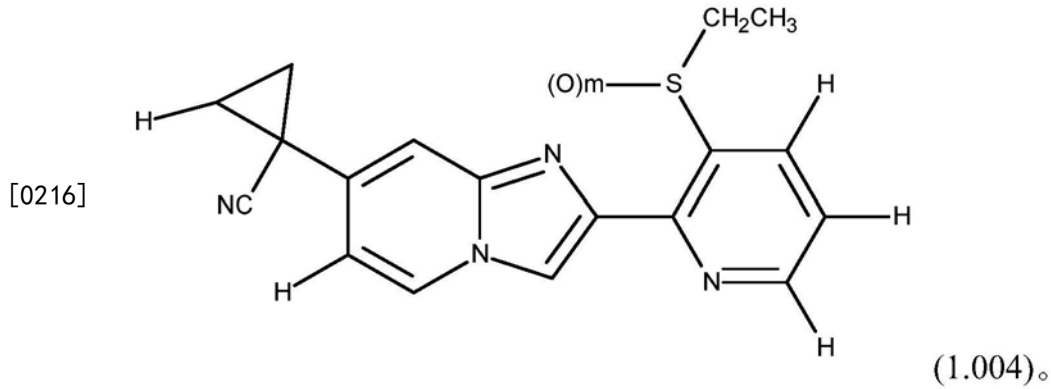
[0213] 组 1: 该组 披露了具有化学式 (Iaa) 的 27 个化合物 1.001 至 1.027:

[0214]

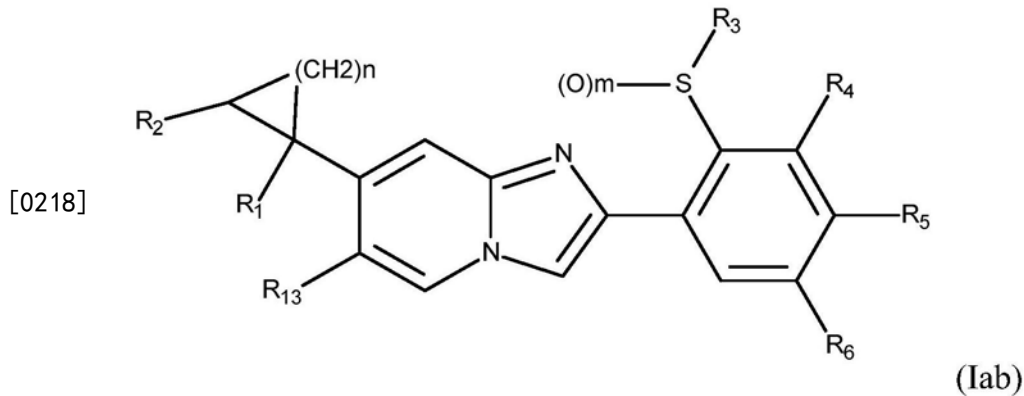


(Iaa)

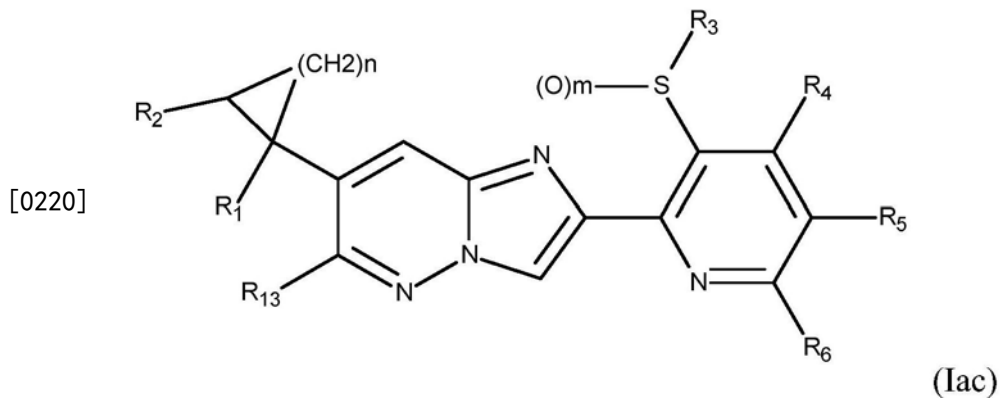
[0215] 其中 n 是 1, m 是 2 并且 R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆ 和 R₁₃ 是如在表 X 中在 X.001-X.027 行中所定义的。例如, 化合物 1.004 具有以下结构:



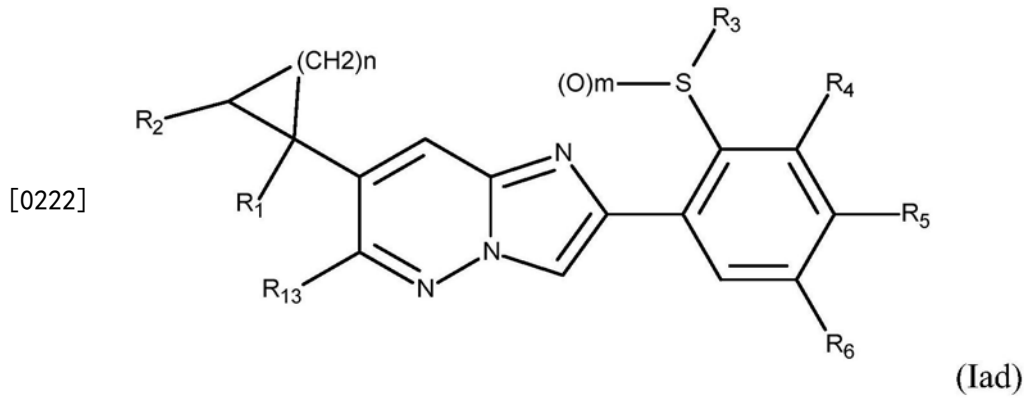
[0217] 组 2: 该组 披露了具有化学式 (Iab) 的 27 个化合物 2.001 至 2.027, 其中 n 是 1, m 是 2 并且 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 和 R_{13} 是如在表 X 中的 X.001- X.027 行中所定义的:



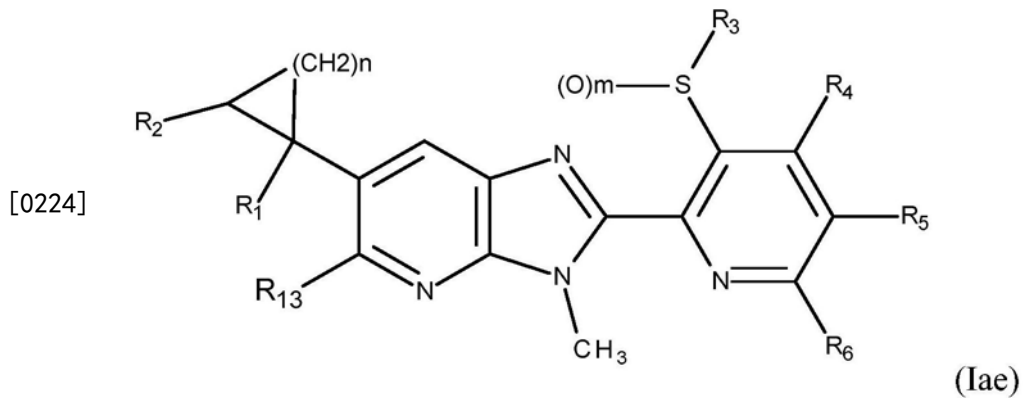
[0219] 组 3: 该组 披露了具有化学式 (Iac) 的 27 个化合物 3.001 至 3.027, 其中 n 是 1, m 是 2 并且 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 和 R_{13} 是如在表 X 中的 X.001- X.027 行中所定义的。



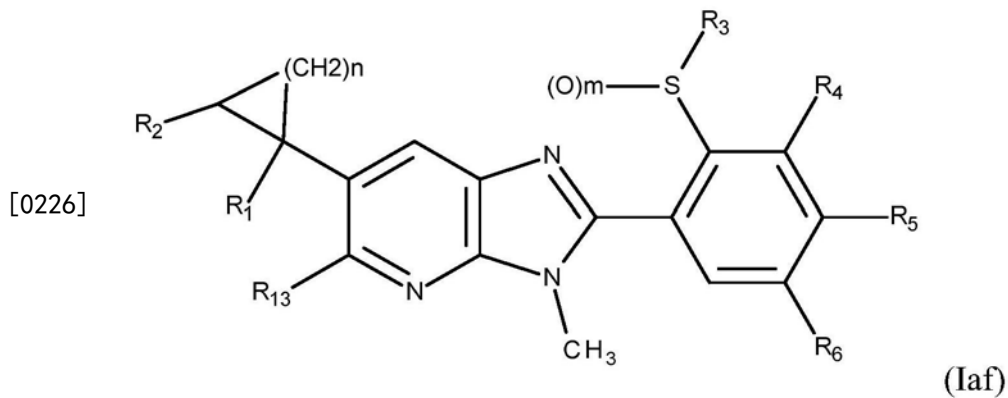
[0221] 组 4: 该组 披露了具有化学式 (Iad) 的 27 个化合物 4.001 至 4.027, 其中 n 是 1, m 是 2 并且 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 和 R_{13} 是如在表 X 中的 X.001- X.027 行中所定义的。



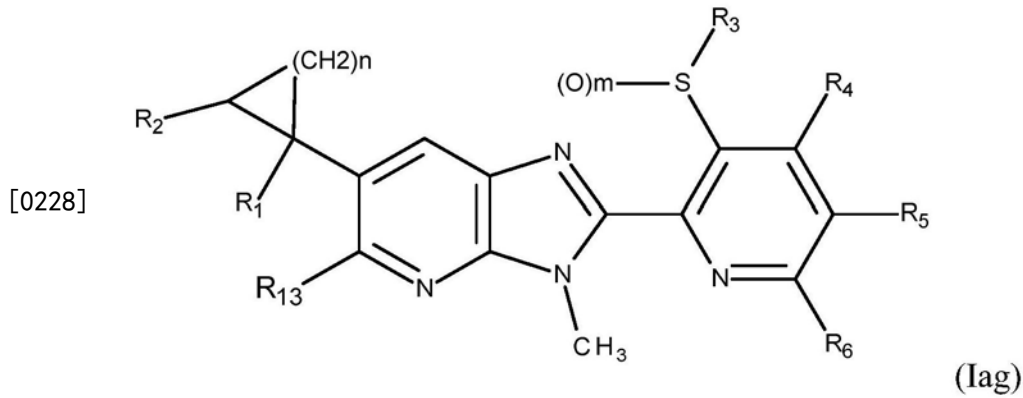
[0223] 组 5: 该组 披露了具有化学式 (Iae) 的 27 个化合物 5.001 至 5.027, 其中 n 是 1, m 是 2 并且 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 和 R_{13} 是如在表 X 中的 X.001- X.027 行中所定义的。



[0225] 组 6: 该组 披露了具有化学式 (Iaf) 的 27 个化合物 6.001 至 6.027, 其中 n 是 1, m 是 2 并且 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 和 R_{13} 是如在表 X 中的 X.001- X.027 行中所定义的。

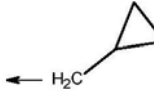


[0227] 组 7: 该组 披露了具有化学式 (Iag) 的 27 个化合物 7.001 至 7.027, 其中 n 是 2, m 是 2 并且 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 和 R_{13} 是如在表 X 中的 X.001- X.027 行中所定义的。



[0229] 表Y:该表披露了对于化学式 (Iah)、(Iai)、(Iaj) 和 (Iak) 的24个取代基指定为 Y.001至Y.024,这些化学式在表Y之后披露:

[0230] 在表Y中,Et代表CH₂CH₃,CH₂Cyp代表

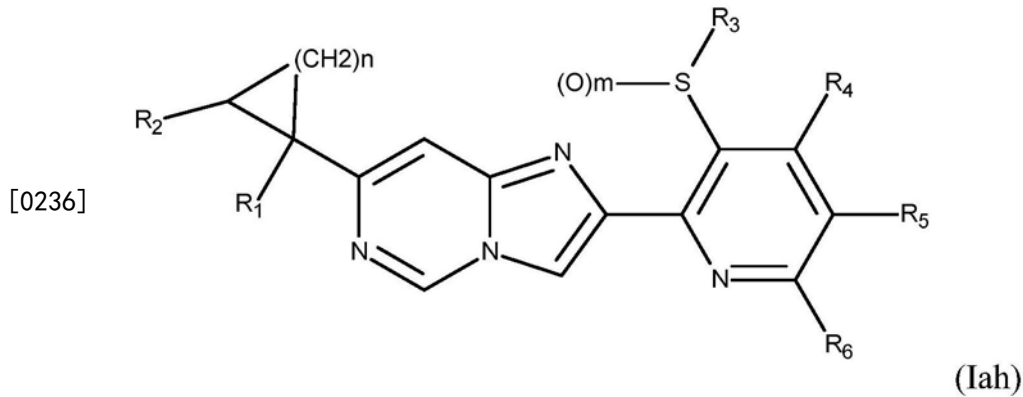
[0231]  其中箭头代表衔接至硫的点。

[0232] 表Y

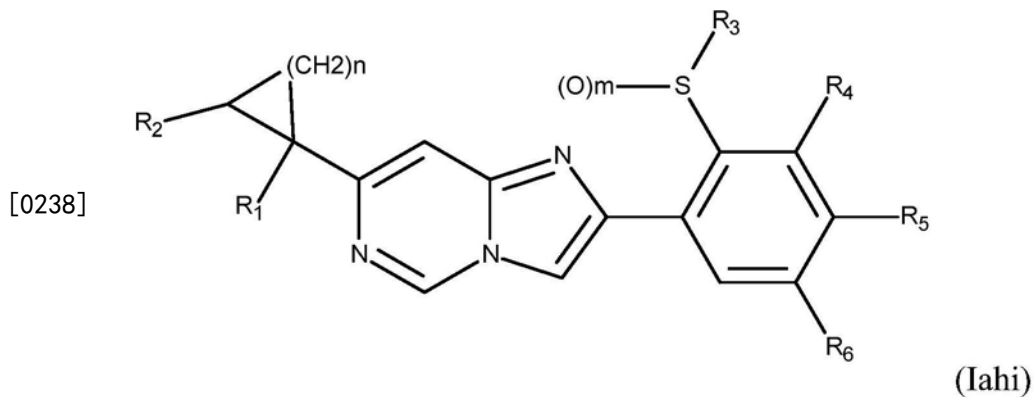
化合物 编号	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆
Y.001	H	H	Et	H	CF ₃	H
Y.002	CN	H	Et	H	CF ₃	H
Y.003	H	H	Et	H	H	H
Y.004	CN	H	Et	H	H	H
Y.005	H	H	Et	H	OCHF ₂	H
Y.006	CN	H	Et	H	OCHF ₂	H
Y.007	H	CN	Et	H	CF ₃	H
Y.008	H	CN	Et	H	H	H
[0233] Y.009	H	H	CH ₂ Cyp	H	CF ₃	H
Y.010	CN	H	CH ₂ Cyp	H	CF ₃	H
Y.011	H	H	CH ₂ Cyp	H	H	H
Y.012	CN	H	CH ₂ Cyp	H	H	H
Y.013	H	H	CH ₂ Cyp	H	OCHF ₂	H
Y.014	CN	H	CH ₂ Cyp	H	OCHF ₂	H
Y.015	H	CF ₃	Et	H	OCHF ₂	H
Y.016	CF ₃	H	Et	H	OCHF ₂	H
Y.017	H	CF ₃	Et	H	CF ₃	H

化合物编号	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆
Y.018	CF ₃	H	Et	H	CF ₃	H
Y.019	H	CF ₃	Et	H	H	H
Y.020	CF ₃	H	Et	H	H	H
Y.021	CN	H	Et	H	4-(三氟甲基)-苯基	H
Y.022	CN	H	Et	H	5-氯-2-嘧啶基	H
Y.023	CN	H	Et	H	4-氯苯基	H
Y.024	CN	H	Et	H	2-嘧啶基	H

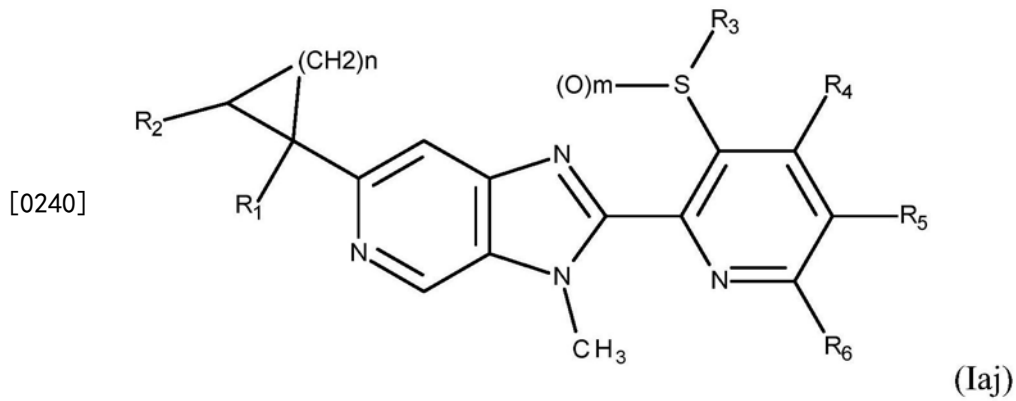
[0234] 组 8: 该组 披露了具有化学式 (Iah) 的24个化合物8.001至8.024, 其中 n是1,m是2并且R₁、R₂、R₃、R₄、R₅和R₆是如在表Y中的Y.001-Y.024 行中所定义的。



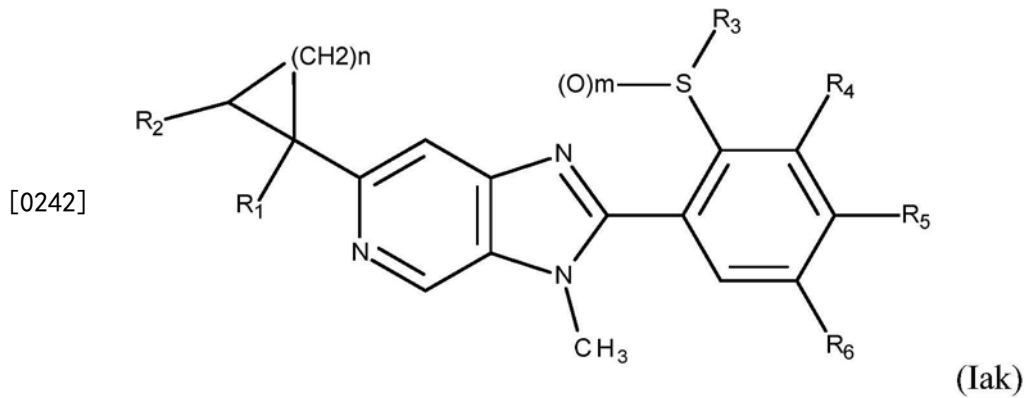
[0237] 组 9: 该组 披露了具有化学式 (Iai) 的24个化合物9.001至9.024, 其中n 是1,m是2并且R₁、R₂、R₃、R₄、R₅和R₆是如在表Y中的Y.001-Y.024行中所定义的。



[0239] 组 10: 该组 披露了具有化学式 (Iaj) 的24个化合物10.001至10.024, 其中n是1,m是2并且R₁、R₂、R₃、R₄、R₅和R₆是如在表Y中的Y.001- Y.024行中所定义的。



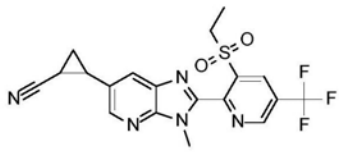
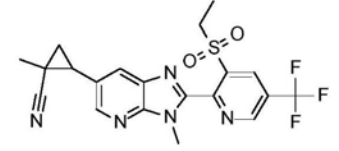
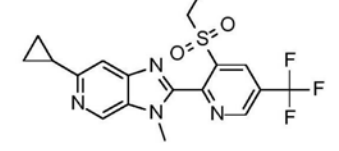
[0241] 组 11: 该组 披露了具有化学式 (Iak) 的 24 个化合物 11.001 至 11.024, 其中 n 是 1, m 是 2 并且 R₁、R₂、R₃、R₄、R₅ 和 R₆ 是如在表 Y 中的 Y.001- Y.024 行中所定义的。



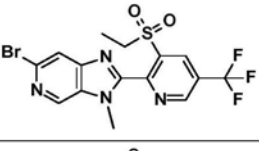
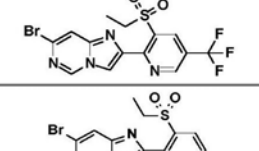
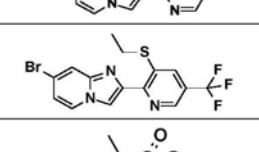
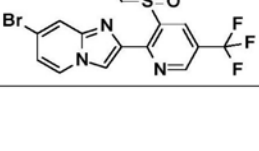

[0243] 表 A1:

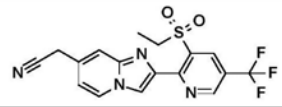
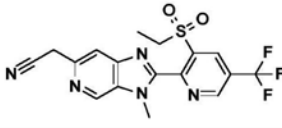
[0244] 所制备的化合物的物理化学数据:

实例	化合物	保留时间 (min)	(M+H) 测量的	方法	Mpt. °C
P1	 (化合物 5.001)	1.01	411	G	99-100
P2	 (化合物 5.002)	0.94	436	G	
P3	 (化合物 5.003)	0.98	450	G	

实例	化合物	保留时间 (min)	(M+H) 测量的	方法	Mpt. °C
	(化合物 7.002)				
P4	 (化合物 5.007)	0.89	436	G	
[0246] P5	 (化合物 10.002)	0.91	436 (M+H- CH3)	G	224-225
P6	 (化合物 10.002)	0.68	411	G	179°C- 180°C

[0247] 表B1 :所制备的具有化学式(II)和化学式(III)的中间体化合物的物理化学数据。

条目编号	化合物	保留时间 (min)	(M+H) 测量的	方法	Mpt. °C
I-1		0.95	449/451	G	188°C- 190°C
I-2		0.94	435/437	G	-
[0248] I-3		0.74	366/368	G	189°C- 190°C
I-4		0.99	402/404	G	
I-5		0.99	434/436	G	187°C- 188°C

条目编号	化合物	保留时间 (min)	(M+H) 测量的	方法	Mpt.°C
[0249] I-6		0.84	395	G	229°C-230°C
I-7		0.81	410	G	169°C-170°C

[0250] 根据本发明的具有化学式I的化合物在有害生物控制领域中是有预防和/或治疗价值的活性成分,即使是在低的施用量下,它们具有非常有利的杀生物谱并且是温血物种、鱼以及植物良好耐受的。根据本发明的这些活性成分作用于正常敏感的以及还有抗药的动物有害生物(如昆虫或蜱螨目的代表)的所有的或个别的发育阶段。根据本发明的活性成分的杀昆虫或杀螨活性可以本身直接显示,亦即或者立即或者仅在过去一些时间之后(例如在蜕皮期间)发生破坏有害生物;或间接显示,例如降低产卵和/或孵化率。

[0251] 上述动物有害生物的实例是:

[0252] 来自蜱螨目,例如,

[0253] 下毛瘿螨属(*Acalitus* spp.)、针刺瘿螨属(*Aculus* spp.)、窄瘿螨属(*Acaricalus* spp.)、瘤瘿螨属(*Aceria* spp.)、粗脚粉螨(*Acarus siro*)、钝眼蜱属(*Amblyomma* spp.)、锐缘蜱属(*Argas* spp.)、牛蜱属(*Boophilus* spp.)、短须螨属(*Brevipalpus* spp.)、苔螨属(*Bryobia* spp.)、上三节瘿螨属(*Calipitrimerus* spp.)、皮螨属(*Chorioptes* spp.)、鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*)、表皮螨属(*Dermatophagoides* spp.)、始叶螨属(*Eotetranychus* spp.)、瘿螨属(*Eriophyes* spp.)、半跗线螨属(*Hemitarsonemus* spp.)、璃眼蜱属(*Hyalomma* spp.)、硬蜱属(*Ixodes* spp.)、小爪螨属(*Olygonychus* spp.)、钝缘蜱属(*Ornithodoros* spp.)、侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonella latus*)、全爪螨属(*Panonychus* spp.)、桔芸锈螨(*Phyllocoptruta oleivora*)、植食螨(*Phytonemus* spp.)、跗线螨属(*Polyphagotarsonemus* spp.)、痒螨属(*Psoroptes* spp.)、扇头蜱属(*Rhipicephalus* spp.)、根嗜螨属(*Rhizoglyphus* spp.)、疥螨属(*Sarcoptes* spp.)、狭跗线螨属(*Steneotarsonemus* spp.)、跗线属(*Tarsonemus* spp.)以及叶螨属(*Tetranychus* spp.);

[0254] 来自虱目,例如,

[0255] 血虱属、长颚虱属、人虱属、天疱疮属以及木虱属;

[0256] 来自鞘翅目,例如,

[0257] 缺隆叩甲属、欧洲鳃角金龟(*Amphimallon majale*)、东方异丽金龟、花象属、蜉金龟属、玉米拟花萤(*Astylus atromaculatus*)、*Ataenius*属、甜菜隐食甲(*Atomaria linearis*)、甜菜胫跳甲、萤叶甲属(*Cerotoma* spp.)、单叶叩甲属、根颈象属、绿金龟、象虫属、圆头犀金龟属、圆头犀金龟属、根萤叶甲属、阿根廷兜虫(*Diloboderus abderus*)、食植瓢虫属、*Eremnus*属、黑异爪蔗金龟、咖啡果小蠹、*Lagria vilosa*、马铃薯甲虫、稻水象属、*Liogenys*属、*Maecolaspis*属、栗色绒金龟、*Megascelis*属、*Melighetes aeneus*、金龟属、*Myochrous armatus*、锯谷盗属、耳喙象属(*Otiorhynchus* spp.)、鳃角金龟属、斑象属、丽金龟属、油菜跳甲属、*Rhyssomatus aubtilis*、劫根蠹属、金龟子科、米象属、麦蛾属、伪切根虫

属、Sphenophorus属、大豆茎象、拟步行虫属、拟谷盗属以及斑皮蠹属；

[0258] 来自双翅目，例如，

[0259] 伊蚊属、疟蚊属、高粱芒蝇、橄榄果实蝇 (*Bactrocea oleae*)、花园毛蚊、迟眼蕈蚊属 (*Bradysia* spp.)、红头丽蝇、小条实蝇属、金蝇属、库蚊属、黄蝇属、寡鬃实蝇属、地种蝇属、黑腹果蝇、厕蝇属、胃蝇属、*Geomyza tripunctata*、舌蝇属、皮蝇属、虱蝇属、斑潜蝇属、绿蝇属、潜蝇属、家蝇属、狂蝇属、瘿蚊属、瑞典麦秆蝇、黎泉蝇、草种蝇属、绕实蝇属、*Rivelia quadrifasciata*、*Scatella*属、蕈蚊属、刺蝇属、虻属、绦虫属及大蚊属；

[0260] 来自半翅目，例如，

[0261] 瘤缘蝽 (*Acanthocoris scabrator*)、绿蝽属、苜蓿盲蝽、*Amblypelta nitida*、海虾盾缘蝽 (*Bathycoelia thalassina*)、土长蝽属、臭虫属、*Clavigralla tomentosicollis*、盲蝽属 (*Creontiades* spp.)、可可瘤盲蝽、*Dichelops furcatus*、棉红蝽属、*Edessa*属、美洲蝽属 (*Euchistus* spp.)、六斑菜蝽 (*Eurydema pulchrum*)、扁盾蝽属、茶翅蝽、具凹巨股长蝽 (*Horcias nobilellus*)、稻缘蝽属、草盲蝽属、热带硕蚱属、卷心菜斑色蝽 (*Murgantia histrionic*)、*Neomegalotomus*属、烟盲蝽 (*Nesidiocoris tenuis*)、绿蝽属、拟长蝽 (*Nysius simulans*)、*Oebalus insularis*、皮蝽属、壁蝽属、红猎蝽属、可可盲蝽象、*Scaptocoris castanea*、黑蝽属 (*Scotinophara* spp.)、*Thyanta*属、锥鼻虫属、木薯网蝽 (*Vatiga illudens*)；

[0262] 无网长管蚜属、*Adalges*属、*Agalliana ensigera*、塔尔吉奥尼木虱 (*Agonoscena targionii*)、粉虱属 (*Aleurodicus* spp.)、刺粉虱属 (*Aleurocanthus* spp.)、甘蔗穴粉虱、软毛粉虱 (*Aleurothrixus floccosus*)、甘蓝粉虱 (*Aleyrodes brassicae*)、棉叶蝉 (*Amarasca biguttula*)、檬果长突叶蝉 (*Amritodus atkinson*)、肾圆盾蚱属、蚜科、蚜属、蚱属 (*Aspidiotus* spp.)、茄沟无网蚜、马铃薯木虱 (*Bactericera cockerelli*)、小粉虱属、短尾蚜属 (*Brachycaudus* spp.)、甘蓝蚜、喀木虱属、双尾蚜 (*Cavariella aegopodii* Scop.)、蜡蚱属、褐圆蚱、网籽草叶圆蚱、大叶蝉属 (*Cicadella* spp.)、大白叶蝉 (*Cofana spectra*)、隐瘤蚜属、叶蝉属 (*Cicadulina* spp.)、褐软蚱、玉米黄翅叶蝉、裸粉虱属、柑橘木虱、麦双尾蚜、西圆尾蚜属、小绿叶蝉属、苹果绵蚜、葡萄斑叶蝉属、蜡蛤属、赤桉木虱 (*Glycaspis brimblecombei*)、菜缢管蚜、大尾蚜属 (*Hyalopterus* spp.)、超瘤蚜种、檬果绿叶蝉 (*Idioscopus clypealis*)、非洲叶蝉 (*Jacobiasca lybica*)、灰飞虱属、球坚蚱、蛎盾蚱属、萝卜蚜 (*Lopaphis erysimi*)、*Lyogenys maidis*、长管蚜属、沫蝉属 (*Mahanarva* spp.)、蛾蜡蝉科 (*Metcalfa pruinosa*)、麦无网蚜、*Myndus crudus*、瘤蚜属、台湾韭蚜、黑尾叶蝉属、褐飞虱属 (*Nilaparvata* spp.)、梨大绿蚜、狗牙根草芥壳虫 (*Odonaspis ruthae*)、寄生甘蔗绵蚜、杨梅缘粉虱、考氏木虱、片盾蚱属、瘿绵蚜属、玉米蜡蝉、扁角飞虱属、忽布疣蚜、根瘤蚜属、动性球菌属、白盾蚱属、粉蚱属、棉盲蝽 (*Pseudatomoscelis seriatus*)、木虱属、棉蚱 (*Pulvinaria aethiopica*)、笠圆盾蚱属、*Quesada gigas*、电光叶蝉 (*Recilia dorsalis*)、缢管蚜属、黑盔蚱属、带叶蝉属、二叉蚜属、麦蚜属 (*Sitobion* spp.)、白背飞虱、三角苜蓿跳虫 (*Spissistilus festinus*)、条斑飞虱 (*Tarophagus Proserpina*)、声蚜属、粉虱属、*Tridiscus sporoboli*、葵粉蚱属 (*Trionymus* spp.)、非洲木虱、桔矢尖蚱、火焰斑叶蝉 (*Zygina flammigera*)、*Zyginidia scutellaris*；

[0263] 来自膜翅目，例如，

[0264] 顶切叶蚁属、三节叶蜂属 (*Arge* spp.)、布切叶白蚁属、茎叶蜂属、松叶蜂属、锯角叶蜂科、松叶蜂 (*Gilpinia polytoma*)、梨实蜂属、毛蚁属、小黄家蚁、新松叶蜂属、农蚁属、*Slenopsis invicta*、水蚁属以及胡蜂属；

[0265] 来自等翅目，例如，

[0266] 家白蚁属、白蚁 (*Cornitermes cumulans*)、楹白蚁属、大白蚁属、澳白蚁属、小白蚁属、散白蚁属；热带火蚁

[0267] 来自鳞翅目，例如，

[0268] 长翅卷蛾属、褐带卷蛾属、透翅蛾属、地夜蛾属、棉叶虫、*Amylois* 属、黎豆夜蛾、黄卷蛾属、银蛾属 (*Argyresthia* spp.)、带卷蛾属、丫纹夜蛾属、棉潜蛾、玉米楷夜蛾、粉斑螟蛾、桃蛀果蛾、禾草螟属、卷叶蛾属、越蔓桔草螟 (*Chrysoteuchia topiaria*)、葡萄果蠹蛾、卷叶螟属、云卷蛾属、纹卷蛾属、鞘蛾属、鳞翅目粉蝶、*Cosmophila flava*、草螟属、大菜螟、苹果异形小卷蛾、黄杨木蛾、小卷蛾属、黄杨绢野螟、杆草螟属、苏丹棉铃虫、金刚钻属、非洲茎螟、粉螟属、叶小卷蛾属 (*Epinotia* spp.)、细斑灯蛾、*Etiella zinckinella*、花小卷蛾属、环针单纹蛾、黄毒蛾属、切根虫属、*Feltia jaculiferia*、*Grapholita* 属、绿青虫蛾、实夜蛾属、菜螟、切叶野螟属 (*Herpetogramma* spp.)、美国白蛾、番茄蠹蛾、*Lasmopalpus lignosellus*、旋纹潜叶蛾、潜叶细蛾属、葡萄花翅小卷蛾、*Loxostege bifidalis*、毒蛾属、潜蛾属、幕枯叶蛾属、甘蓝夜蛾、烟草天蛾、*Mythimna* 属、夜蛾属、秋尺蛾属、*Orniodes indica*、欧洲玉米螟、超小卷蛾属、褐卷蛾属、小眼夜蛾、蛀茎夜蛾、*Pectinophora gossypiella*、咖啡潜叶蛾、一星黏虫、马铃薯麦蛾、菜粉蝶、粉蝶属、小菜蛾、芽蛾属、尺叶蛾属、薄荷灰夜蛾、西方豆地香 (*Richia albicosta*)、白禾螟属 (*Scirpophaga* spp.)、蛀茎夜蛾属、长须卷蛾属、灰翅夜蛾属、棉大卷叶螟、兴透翅蛾属、异舟蛾属、卷叶蛾属、粉纹夜蛾、番茄斑潜蝇、以及巢蛾属；

[0269] 来自食毛目，例如，

[0270] 畜虱属和啮毛虱属；

[0271] 来自直翅目，例如，

[0272] 螻属、小螻属、蝼蛄属、马德拉蜚螻、飞蝗属、北痣蟋蟀 (*Neocurtilla hexadactyla*)、大螻属、痣蟋蟀属 (*Scapteriscus* spp.)、以及沙漠蝗属；

[0273] 来自啮虫目，例如，

[0274] 虱啮属 (*Liposcelis* spp.)；

[0275] 来自蚤目，例如，

[0276] 角叶蚤属、栉头蚤属和开皇客蚤；

[0277] 来自缨翅目，例如，

[0278] *Calliothrips phaseoli*、花蓟马属、阳蓟马属、褐带蓟马属、单亲蓟马属 (*Parthenothrips* spp.)、橙花昔硬蓟马 (*Scirtothrips aurantii*)、豆蓟马 (*Sericothrips variabilis*)、带蓟马属、蓟马属；

[0279] 来自缨尾目，例如，衣鱼 (*Lepisma saccharina*)。

[0280] 根据本发明的这些活性成分可以用于控制(即限制或破坏)出现在特别是在植物上,尤其是在农业、园艺和森林中的有用植物和观赏植物上,或在这样的植物的器官如果实、花、叶、秆、块茎或根上的上述类型的有害生物,并且在一些情况下,甚至在较晚的时间

点形成的植物器官上仍然针对这些有害生物的保护。

[0281] 适宜的目标作物具体是,谷物,如小麦、大麦、黑麦、燕麦、水稻、玉米或高粱;甜菜,如糖用甜菜或饲料甜菜;水果,例如梨果、核果或无核小果,如苹果、梨、李子、桃、杏、樱桃或浆果,例如草莓、覆盆子或黑莓;豆科作物,如菜豆、小扁豆、豌豆或大豆;油料作物,如油菜、芥菜、罂粟、橄榄、向日葵、椰子、蓖麻、可可豆或落花生;瓜类作物,如南瓜、黄瓜或甜瓜;纤维植物,如棉花、亚麻、大麻或黄麻;柑橘类水果,如橙子、柠檬、葡萄柚或橘子;蔬菜,如菠菜、莴苣、芦笋、卷心菜、胡萝卜、洋葱、番茄、马铃薯或灯笼椒;樟科,如鳄梨、肉桂或樟脑;以及还有烟草、坚果、咖啡、茄子、甘蔗、茶、胡椒、葡萄藤、蛇麻草、车前草科、胶乳植物以及观赏植物。

[0282] 根据本发明的这些活性成分尤其适合于控制棉花、蔬菜、玉米、水稻以及大豆作物上的扁豆蚜、黄瓜条叶甲、烟芽夜蛾、桃蚜、小菜蛾以及海灰翅夜蛾。根据本发明的这些活性成分另外尤其适合于控制甘蓝夜蛾(优选地在蔬菜上)、苹果蠹蛾(优选地在苹果上)、小绿叶蝉(优选地在蔬菜、葡萄园里)、马铃薯叶甲(优选地在马铃薯上)以及二化螟(优选地在水稻上)。

[0283] 在另一个方面,本发明还可以涉及控制由植物寄生的线虫(内寄生的-、半内寄生的-以及外寄生的线虫)对植物或其部分引起损害的方法,尤其是以下植物寄生的线虫,如根结线虫(root knot nematodes)、北方根结线虫 (*Meloidogyne hapla*)、南方根结线虫 (*Meloidogyne incognita*)、爪哇根结线虫 (*Meloidogyne javanica*)、花生根结线虫 (*Meloidogyne arenaria*) 以及其他根结线虫属种类 (*Meloidogyne species*);孢囊形成线虫(cyst-forming nematodes)、马铃薯金线虫 (*Globodera rostochiensis*) 以及其他球孢囊线虫属种类 (*Globodera species*);禾谷孢囊线虫 (*Heterodera avenae*)、大豆孢囊线虫 (*Heterodera glycines*)、甜菜孢囊线虫 (*Heterodera schachtii*)、红三叶异皮线虫 (*Heterodera trifolii*)、以及其他异皮线虫属种类 (*Heterodera species*);种瘿线虫 (Seed gall nematodes)、粒线虫属种类 (*Anguina species*);茎及叶面线虫 (Stem and foliar nematodes)、滑刃线虫属种类 (*Aphelenchoides species*);刺毛线虫 (Sting nematodes)、长尾刺线虫 (*Belonolaimus longicaudatus*) 以及其他刺线虫属种类;松树线虫 (Pine nematodes)、松材线虫 (*Bursaphelenchus xylophilus*) 以及其他伞滑刃属种类 (*Bursaphelenchus species*);环形线虫 (Ring nematodes)、环线虫属种类 (*Criconema species*)、小环线虫属种类 (*Criconemella species*)、轮线虫属种类 (*Criconemoides species*)、中环线虫属种类 (*Mesocriconema species*);茎及鳞球茎线虫 (Stem and bulb nematodes)、腐烂茎线虫 (*Ditylenchus destructor*)、鳞球茎茎线虫 (*Ditylenchus dipsaci*) 以及其他茎线虫属种类 (*Ditylenchus species*);锥线虫 (Awl nematodes)、锥线虫属种类 (*Dolichodorus species*);螺旋线虫 (Spiral nematodes)、多头螺旋线虫 (*Heliocotylenchus multincinctus*) 以及其他螺旋线虫属种类 (*Helicotylenchus species*);鞘及鞘形线虫 (Sheath and sheathoid nematodes)、鞘线虫属种类 (*Hemicyclophora species*) 以及半轮线虫属种类 (*Hemicriconemoides species*);潜根线虫属种类 (*Hirshmanniella species*);支线虫 (Lance nematodes)、冠线虫属种类 (*Hoploaimus species*);假根结线虫 (false rootknot nematodes)、珍珠线虫属种类 (*Nacobbus species*);针状线虫 (Needle nematodes)、横带长针线虫 (*Longidorus*

elongatus) 以及其他长针线虫属种类 (Longidorus species); 大头针线虫 (Pin nematodes)、短体线虫属种类 (Pratylenchus species); 腐线虫 (Lesion nematodes)、花斑短体线虫 (Pratylenchus neglectus)、穿刺短体线虫 (Pratylenchus penetrans)、弯曲短体线虫 (Pratylenchus curvatus)、古氏短体线虫 (Pratylenchus goodeyi) 以及其他短体线虫属种类 (Pratylenchus species); 柑桔穿孔线虫 (Burrowing nematodes)、香蕉穿孔线虫 (Radopholus similis) 以及其他内侵线虫属种类 (Radopholus species); 肾形线虫 (Reniform nematodes)、罗柏氏盘旋线虫 (Rotylenchus robustus)、肾形盘旋线虫 (Rotylenchus reniformis) 以及其他盘旋线虫属种类 (Rotylenchus species); 盾线虫属种类 (Scutellonema species); 短粗根线虫 (Stubby root nematodes)、原始毛刺线虫 (Trichodorus primitivus) 以及其他毛刺线虫属种类 (Trichodorus species)、拟毛刺线虫属种类 (Paratrichodorus species); 矮化线虫 (Stunt nematodes)、马齿苋矮化线虫 (Tylenchorhynchus claytoni)、顺逆矮化线虫 (Tylenchorhynchus dubius) 以及其他矮化线虫属种类 (Tylenchorhynchus species); 柑桔线虫 (Citrus nematodes)、穿刺线虫属种类 (Tylenchulus species); 短剑线虫 (Dagger nematodes)、剑线虫属种类 (Xiphinema species); 以及其他植物寄生的线虫种类, 如亚粒线虫属 (Subanguina spp.)、Hypsoperine 属、大刺环线虫属 (Macroposthonia spp.)、Melinius 属、刻点胞囊属 (Punctodera spp.)、以及五沟线虫属 (Quinisulcius spp.)。

[0284] 本发明的这些化合物还具有针对软体动物的活性。这些软体动物的实例包括, 例如苹果螺科; 阿勇蛞蝓属 (Arion) (灰黑阿勇蛞蝓 (A. ater)、环斑阿勇蛞蝓 (A. circumscriptus)、庭院阿勇蛞蝓 (A. hortensis)、红棕阿勇蛞蝓 (A. rufus)); 巴蜗牛科 (灌木巴蜗牛 (Bradybaena fruticum)); 蜗牛属 (庭院蜗牛 (C. hortensis)、森林蜗牛 (C. nemoralis)); ochlodina; 灰蛞蝓属 (Deroceras) (野灰蛞蝓 (D. agrestis)、D. empiricorum、田灰蛞蝓 (D. laeve)、庭园灰蛞蝓 (D. reticulatum)); 圆盘螺属 (Discus) (D. rotundatus); Euomphalia; 土蜗属 (Galba) (截形土蜗 (G. trunculata)); 小蜗牛属 (Helicelia) (伊塔拉小蜗牛 (H. itala)、布维小蜗牛 (H. obvia)); 大蜗牛科 Helicigona arbustorum; Helicodiscus; 大蜗牛属 (Helix) (开放大蜗牛 (H. aperta)); 蛞蝓属 (Limax) (灰黑蛞蝓 (L. cinereoniger)、黄蛞蝓 (L. flavus)、边缘蛞蝓 (L. marginatus)、大蛞蝓 (L. maximus)、柔蛞蝓 (L. tenellus)); 椎实螺属 (Lymnaea); Milax (M. gagates、M. marginatus、M. sowerbyi); 钻螺属 (Opeas); 瓶螺属 (Pomacea) (P. canaticulata); 瓦娄蜗牛属 (Vallonia) 和 Zanitoides。

[0285] 术语“作物”应理解为还包括已经通过使用重组DNA技术而被这样转化使其能够合成一种或多种选择性作用毒素的作物植物, 这些毒素如已知, 例如来自产毒素的细菌, 尤其是芽孢杆菌属的那些。

[0286] 可以通过此类转基因植物表达的毒素包括例如杀昆虫蛋白, 例如来自于蜡样芽孢杆菌或日本甲虫芽孢杆菌的杀昆虫蛋白; 或来自于苏云金芽孢杆菌的杀昆虫蛋白, 如 δ -内毒素, 例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C, 或营养期杀虫蛋白 (Vip), 例如 Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A; 或线虫寄生性细菌的杀虫蛋白, 例如光杆状菌属或致病杆菌属, 如发光光杆状菌、嗜线虫致病杆菌; 由动物产生的毒素, 如蝎毒素、蜘蛛毒素、黄蜂毒素和其他昆虫特异性神经毒素; 由真菌产生的毒素, 如链霉菌毒素; 植物凝集

素,如豌豆凝集素、大麦凝集素或雪花莲凝集素;凝集素类;蛋白酶抑制剂,如胰蛋白酶抑制剂、丝氨酸蛋白酶抑制剂、马铃薯贮存蛋白(patatin)、半胱氨酸蛋白酶抑制剂、木瓜蛋白酶抑制剂;核糖体失活蛋白(RIP),如蓖麻蛋白、玉米-RIP、相思豆毒蛋白、丝瓜籽毒蛋白、皂草毒素蛋白或异株泻根毒蛋白;类固醇代谢酶,如3-羟基类固醇氧化酶、蜕皮类固醇-UDP-糖基-转移酶、胆固醇氧化酶、蜕皮激素抑制剂、HMG-COA-还原酶,离子通道阻断剂,如钠通道或钙通道阻断剂,保幼激素酯酶,利尿激素受体、芪合酶、联苳合酶、几丁质酶和葡聚糖酶。

[0287] 在本发明背景下, δ -内毒素例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C,或营养期杀昆虫蛋白(Vip),例如 Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A应理解为显然还包括混合型毒素、截短的毒素和经修饰的毒素。混合型毒素是通过那些蛋白的不同区域的新组合重组产生的(参见,例如WO 02/15701)。截短的毒素例如截短的Cry1Ab是已知的。在经修饰毒素的情况下,天然产生的毒素的一个或多个氨基酸被置换。在这种氨基酸置换中,优选将非天然存在的蛋白酶识别序列插入毒素中,例如像在Cry3A055的情况下,组织蛋白酶-G-识别序列被插入Cry3A毒素中(参见WO 03/018810)。

[0288] 这样的毒素或能够合成这样的毒素的转基因植物的实例披露于例如EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451 878 以及WO 03/052073中。

[0289] 用于制备这样的转基因植物的方法对于本领域的普通技术人员而言通常是已知的并且描述在例如以上提及的公开物中。CryI-型脱氧核糖核酸及其制备例如从WO 95/34656、EP-A-0 367 474、EP-A-0 401 979以及WO 90/13651 中已知。

[0290] 包括在转基因植物中的毒素使得植物对有害昆虫有耐受性。这些昆虫可以存在于任何昆虫分类群,但尤其是通常在甲虫(鞘翅目)、双翅昆虫(双翅目)和蛾(鳞翅目)中发现。

[0291] 包含一种或多种编码杀虫剂抗性并且表达一种或多种毒素的基因的转基因植物是已知的并且其中一些是可商购的。此类植物的实例为: **YieldGard®** (玉米品种,表达Cry1Ab毒素); **YieldGard Rootworm®** (玉米品种,表达Cry3Bb1毒素); **YieldGard Plus®** (玉米品种,表达Cry1Ab以及Cry3Bb1毒素); **Starlink®** (玉米品种,表达Cry9C毒素); **Herculex I®** (玉米品种,表达Cry1Fa2毒素以及实现对除草剂草丁膦铵的耐受性的酶磷丝菌素N-乙酰转移酶(PAT)); **NuCOTN 33B®** (棉花品种,表达Cry1Ac毒素); **Bollgard I®** (棉花品种,表达Cry1Ac毒素); **Bollgard II®** (棉花品种,表达Cry1Ac和Cry2Ab毒素); **VipCot®** (棉花品种,表达Vip3A和Cry1Ab毒素); **NewLeaf®** (马铃薯品种,表达Cry3A毒素); **NatureGard®**, **Agrisure® GT Advantage** (GA21耐草甘膦性状), **Agrisure® CB Advantage** (Bt11玉米螟(CB)性状)以及 **Protecta®**。

[0292] 这样的转基因作物的其他实例是:

[0293] 1. Bt11玉米,来自先正达种子子公司(Syngenta Seeds SAS),霍比特路(Chemin de l'Hobit)27,F-31 790圣苏维尔(St. Sauveur),法国,登记号C/FR/96/05/10。遗传修饰的玉蜀黍,通过转基因表达截短的Cry1Ab毒素,使之能抵抗欧洲玉米螟(玉米螟和粉茎螟)的侵袭。Bt11玉米还转基因地表达PAT酶以达到对除草剂草丁膦铵的耐受性。

[0294] 2. Bt176玉米,来自先正达种子子公司,霍比特路27,F-31 790圣苏维尔,法国,登记号C/FR/96/05/10。遗传修饰的玉蜀黍,通过转基因表达Cry1Ab毒素,使之能抵抗欧洲玉米螟(玉米螟和粉茎螟)的侵袭。Bt176玉米还转基因地表达PAT酶以达到对除草剂草丁膦铵的

耐受性。

[0295] 3. MIR604玉米,来自先正达种子,霍比特路27,F-31 790圣苏维尔,法国,登记号C/FR/96/05/10。通过转基因表达经修饰的Cry3A毒素使之具有昆虫抗性的玉米。此毒素是通过插入组织蛋白酶-G-蛋白酶识别序列而经修饰的Cry3A055。此类转基因玉米植物的制备描述于WO 03/018810中。

[0296] 4. MON 863玉米,来自孟山都欧洲公司(Monsanto Europe S.A.)270-272特弗伦大道(Avenue de Tervuren),B-1150布鲁塞尔(Brussels),比利时,登记号C/DE/02/9。MON 863表达Cry3Bb1毒素,并且对某些鞘翅目昆虫有抗性。

[0297] 5. IPC 531棉花,来自孟山都欧洲公司,270-272特弗伦大道,B-1150布鲁塞尔,比利时,登记号C/ES/96/02。

[0298] 6. 1507玉米,来自先锋海外公司(Pioneer Overseas Corporation),特德斯科大道路(Avenue Tedesco),7B-1160布鲁塞尔,比利时,登记号C/NL/00/10。遗传改性的玉米,表达蛋白质Cry1F以获得对某些鳞翅目昆虫的抗性,并且表达PAT蛋白质以获得对除草剂草丁膦铵的耐受性。

[0299] 7. NK603×MON 810玉米,来自孟山都欧洲公司,270-272特弗伦大道,B-1150布鲁塞尔,比利时,登记号C/GB/02/M3/03。通过将遗传修饰的品种NK603和MON 810杂交,由常规育种的杂交玉米品种构成。NK603×MON 810玉米转基因地表达由土壤杆菌属菌株CP4获得的蛋白质CP4 EPSPS,使之耐除草剂Roundup®(含有草甘膦),以及由苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种获得的Cry1Ab毒素,使之耐某些鳞翅目昆虫,包括欧洲玉米螟。

[0300] 抗昆虫的植物的转基因作物还描述于BATS(生物安全与可持续发展中心(Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit),BATS中心(Zentrum BATS),克拉斯崔舍(Clarastrasse)13,巴塞尔(Basel)4058,瑞士)报告2003(<http://bats.ch>)中。

[0301] 术语“作物”应理解为还包括已经通过使用重组DNA技术而被这样转化使其能够合成具有选择性作用的抗病原物质的作物,这些抗病原物质是例如像所谓的“病程相关蛋白”(PRP,参见例如EP-A-0 392 225)。此类抗病原物质以及能够合成此类抗病原物质的转基因植物的实例例如从EP-A-0 392 225、WO 95/33818和EP-A-0 353 191是已知的。生产此类转基因植物的方法对于本领域的普通技术人员而言通常是已知的并且描述于例如以上提及的公开物中。

[0302] 作物也可以经修饰以增加对真菌(例如镰孢霉属、炭疽病或疫霉属)、细菌(例如假单胞菌属)或病毒(例如马铃薯卷叶病毒、番茄斑萎病毒、黄瓜花叶病毒)病原体的抗性。

[0303] 作物还包括那些具有对线虫(如大豆异皮线虫)的增加的抗性的作物。

[0304] 具有对非生物性胁迫的耐受性的作物包括那些例如通过NF-YB或本领域中已知的其他蛋白质的表达具有对干旱、高盐、高温、寒冷、霜或光辐射的增加的耐受性的作物。

[0305] 可以通过这样的转基因植物表达的抗病原物质包括例如离子通道阻断剂,如钠通道和钙通道阻断剂,例如病毒的KP1、KP4或KP6毒素;萜合酶、联苄合酶;几丁质酶;葡聚糖酶;所谓的“病程相关蛋白”(PRP,参见例如EP-A-0 392 225);通过微生物产生的抗病原物质,例如植物病原体防御中涉及的肽抗生素类或杂环抗生素类(参见例如WO 95/33818)或蛋白质或多肽因子(所谓的“植物病害抗性基因”,如WO 03/000906中所述的)。

[0306] 根据本发明的组合物的其他使用范围是保护所储存的货物和储藏环境以及保护

原材料,如木材、纺织品、地板或建筑物,以及在卫生领域中,尤其是保护人类、家畜以及多产的牲畜免遭所提及类型的有害生物。

[0307] 本发明还提供了用于控制有害生物(如蚊和其他的疾病媒介物;同样参见http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/)的方法。在一个实施例中,用于控制有害生物的方法包括通过涂刷、轧制、喷雾、涂布或浸渍,向目标有害生物、它们的场所或表面或基质施用本发明的组合物。通过举例,通过本发明的方法预期了表面(如墙、天花板或地板表面)的IRS(室内滞留喷雾)施用。在另一个实施例中,预期了将此类组合物施用于基质,如无纺或织物材料,该材料处于网织品、被覆物、被褥、窗帘以及帐篷的形式(或可以用于在这些物品的制造中)。本发明的另外的目的因此是选自包含含有有效量的具有化学式I的化合物的组合物的无纺和织物材料的基质。

[0308] 在一个实施例中,用于控制此类有害生物的方法包括向目标有害生物、它们的场所或表面或基质施用杀有害生物有效量的本发明的组合物,以便于在该表面或基质上提供有效的滞留的杀有害生物活性。这样的施用可以通过涂刷、轧制、喷雾、涂布或浸渍本发明的杀有害生物组合物来进行。通过举例,通过本发明的方法预期了表面(如墙、天花板或地板表面)的IRS施用,以便于在该表面上提供有效的滞留的杀有害生物活性。在另一个实施例中,预期了施用此类组合物以用于在基质上的有害生物的滞留的控制,该基质是如处于网织品、被覆物、被褥、窗帘以及帐篷的形式(或可以用于在这些物品的制造中)的织物材料。

[0309] 待处理的基质(包括无纺物、织物或网织品)可以由天然纤维,如棉花、拉菲亚树叶纤维、黄麻、亚麻、剑麻、粗麻布或羊毛,或者合成纤维,如聚酰胺、聚酯、聚丙烯、聚丙烯腈等等制成。聚酯是特别适合的。纺织品处理的方法是已知的,例如WO 2008/151984、WO 2003/034823、US 5631072、WO 2005/064072、WO 2006/128870、EP 1724392、WO 2005/113886或WO 2007/090739。

[0310] 根据本发明的组合物的其他使用范围是针对所有观赏树木连同所有种类的果树和坚果树的树木注射/树干处理领域。

[0311] 在树木注射/树干处理领域中,根据本发明的这些化合物特别适合于对抗来自上述的鳞翅目和来自鞘翅目的钻木昆虫,尤其是对抗下表A和B中列出的钻木虫:

[0312] 表A.具有经济重要性的外来钻木虫的实例。

科	种	受侵染的宿主或作物
吉丁虫科	白蜡窄吉丁	白蜡木(Ash)
天牛科	光肩天牛	硬木
小蠹科	<i>Xylosandrus crassiusculus</i>	硬木
	削尾材小蠹	硬木
	纵坑切梢小蠹	松柏类

[0314] 表B.具有经济重要性的本地钻木虫的实例。

科	种	受侵染的宿主或作物

[0316]

科	种	受感染的宿主或作物
吉丁虫科	桦铜窄吉丁 (<i>Agrilus anxius</i>)	桦树
	磨光窄吉丁 (<i>Agrilus politus</i>)	柳树、枫树
	<i>Agrilus sayi</i>	杨梅、香蕨木
	<i>Agrilus vittaticollis</i>	苹果树、梨树、蔓越橘、唐棣、山楂树
	革扁头吉丁 (<i>Chrysobothris femorata</i>)	苹果树、杏树、山毛榉、白蜡槭、樱桃树、栗树、红醋栗树、榆树、山楂树、朴树、山核桃、欧洲七叶树、菩提树、枫树、欧洲花楸树、橡树、美洲山核桃树、梨树、桃树、柿子树、李子树、杨树、温柏、美国紫荆、唐棣、美国梧桐、核桃树、柳树
<i>Texania campestris</i>	椴木、山毛榉、枫树、橡树、美国梧桐、柳树、黄杨	
天牛科	对山毛榉天牛 (<i>Goes pulverulentus</i>)	山毛榉、榆树、纳托尔 (Nuttall)、柳树、黑橡树、樱皮镰状栎、黑栎、美国梧桐
	虎橡天牛 (<i>Goes tigrinus</i>)	橡树
	黑腹尼虎天牛 (<i>Neoclytus acuminatus</i>)	白蜡木、山核桃树、橡树、核桃树、桦树、山毛榉、枫树、美洲铁木 (Eastern hophornbeam)、山茱萸、柿子树、美国紫荆、冬青、朴树、洋槐、美国皂荚木 (Honeylocust)、黄杨、栗树、奥塞奇橙木 (Osage-orange)、黄樟、紫丁香、短叶紫杉 (Mountain-mahogany)、梨树、樱桃树、李子树、桃树、苹果树、榆树、菩提树、枫香
	三线无花果天牛 (<i>Neoptychodes trilineatus</i>)	无花果树、赤杨木、桑树、柳树、网叶朴树 (Netleaf hackberry)
	灰翅筒天牛 (<i>Oberea ocellata</i>)	漆树、苹果树、桃树、李子树、梨树、红醋栗树、黑莓

[0317]

科	种	受感染的宿主或作物
	<i>Oberea tripunctata</i>	山茱萸、荚蒾属、榆树、酸模树、蓝莓、杜鹃花属、杜鹃、月桂树、杨树、柳树、桑树
	绕枝沟胫天牛 (<i>Oncideres cingulata</i>)	山核桃树、美洲山核桃树、柿子树、榆树、酸模树、菩提树、美国皂荚木、山茱萸、桉树、橡树、朴树、枫树、果树
	对杨黄斑楔天牛 (<i>Saperda calcarata</i>)	杨树
	<i>Strophiona nitens</i>	栗树、橡树、山核桃树、核桃树、山毛榉、枫树
小蠹科	<i>Corthylus columbianus</i>	枫树、橡树、黄杨、山毛榉、白蜡槭、美国梧桐、桦树、菩提树、栗树、榆树
	南方松大小蠹 (<i>Dendroctonus frontalis</i>)	松树
	美桦毛小蠹 (<i>Dryocoetes betulae</i>)	桦树、枫香、野樱桃树、山毛榉、梨树
	黄带芳小蠹 (<i>Monarthrum fasciatum</i>)	橡树、枫树、桦树、栗树、枫香、蓝果木、杨树、山核桃树、含羞草、苹果树、桃树、松树
	桃鳃角小蠹 (<i>Phloeotribus liminaris</i>)	桃树、樱桃树、李子树、黑樱桃树、榆树、桑树、欧洲花楸树
	<i>Pseudopityophthorus pruinosus</i>	橡树、美国山毛榉木、黑樱桃树、契卡索李子树 (<i>Chickasaw plum</i>)、栗树、枫树、山核桃树、角树、铁木
透翅蛾科	栋透翅蛾 (<i>Paranthrene simulans</i>)	橡树、美洲栗树
	<i>Sannina uroceriformis</i>	柿子树
	小桃翅蛾	桃树、李子树、油桃树、樱桃树、杏树、扁桃树、黑樱桃树
	李桃翅蛾 (<i>Synanthedon pictipes</i>)	桃树、李子树、樱桃树、山毛榉、黑樱桃树

科	种	受感染的宿主或作物
[0318]	<i>Synanthedon rubrofascia</i>	蓝果树
	<i>Synanthedon scitula</i>	山茱萸、美洲山核桃、山核桃树、橡树、栗树、山毛榉、桦树、黑樱桃树、榆树、欧洲花楸树、荚蒾属、柳树、苹果树、枇杷树、九层皮、杨梅
	<i>Vitacea polistiformis</i>	葡萄树

[0319] 在卫生领域中,根据本发明的这些组合物是有效地对抗外寄生虫如硬蜱、软蜱、疥螨、秋螨、蝇(叮咬和舔舐)、寄生性蝇幼虫,虱、发虱、鸟虱和蚤。

[0320] 此类寄生虫的实例是:

[0321] 虱目:血虱属、长颚虱属、人虱属和阴虱属、盲虱属。

[0322] 食毛目:毛羽虱属、短角鸟虱属、鸭虱属、牛羽虱属、Werneckiella 属、Lepikentron属、畜虱属、啮毛虱属以及猫羽虱属。

[0323] 双翅目及长角亚目和短角亚目,例如伊蚊属、按蚊属、库蚊属、蚋属、真蚋属、白蛉属、罗蛉属、库蠓属、斑虻属、驼背虻属、黄虻属、虻属、麻虻属、Philipomyia属、蜂虱蝇属、家蝇属、齿股蝇属、螫蝇属、黑角蝇属、莫蝇属、厕蝇属、舌蝇属、丽蝇属、绿蝇属、金蝇属、污蝇属、麻蝇属、狂蝇属、皮蝇属、胃蝇属、虱蝇属、羊虱蝇属和蜉蝣属。

[0324] 蚤目,例如蚤属、栉头蚤属、客蚤属、角叶蚤属。

[0325] 异翅目,例如臭虫属、锥蝽属、红猎蝽属、锥蝽属。

[0326] 蜚蠊目,例如东方蜚蠊、美洲大蠊、德国小蠊以及夏柏拉蟑螂属。

[0327] 蜱螨亚纲(螨科)和后气门目和中气门目,例如锐缘蜱属、钝缘蜱属、耳蜱属、硬蜱属、钝眼蜱属、牛蜱属、革蜱属、血蜱属、璃眼蜱属、扇头蜱属、皮刺螨属、刺利螨属、肺刺螨属、胸刺螨属和瓦螨属。

[0328] 轴螨目(前气门亚目)和粉螨目(无气门亚目),例如蜂盾螨属、姬螯属、禽螯螨属、肉螨属、疮螨属、蠕形螨属、恙螨属、牦螨属、粉螨属、食酪螨属、嗜木螨属、颈下螨属、翅螨属、痒螨属、皮螨属、耳疥螨属、疥螨属、耳螨属、鸟疥螨属、胞螨属以及鸡雏螨属。

[0329] 根据本发明的组合物还适用于保护材料如木材、纺织品、塑料、粘合剂、胶、漆料、纸张和卡片、皮革、地板和建筑等免受昆虫侵染。

[0330] 根据本发明的组合物可以用于例如对抗以下有害生物:甲虫,如北美家天牛、长毛天牛、家具窃蠹、红毛窃蠹、梳角细脉窃蠹、石斛、松芽枝窃蠹、松产品窃蠹、褐粉蠹、非洲粉蠹、南方粉蠹、栎粉蠹、柔毛粉蠹、胸粉蠹、鳞毛粉蠹、材小蠹属、条木小蠹属、咖啡黑长蠹、树长蠹、棕异翅长蠹、双棘长蠹属与竹长蠹;以及膜翅类昆虫,如蓝黑树蜂、云杉大树蜂、泰加大树蜂与大树蜂;以及白蚁,如欧洲木白蚁、麻头堆砂白蚁、印巴结构木异白蚁、黄胸散白蚁、桑特散白蚁、散白蚁、达尔文澳白蚁、内华达古白蚁与家白蚁;以及蛀虫,如衣鱼。

[0331] 本发明因此也涉及杀有害生物组合物,例如在聚合性物质中的可乳化性浓缩物、悬浮液浓缩物、微乳液、油分散剂、直接可喷洒或可稀释的溶液、可涂抹的糊剂、稀乳液、可溶性粉剂、可分散性粉剂、可湿性粉剂、尘剂、颗粒剂或封装剂,这些杀有害生物组合物包含

根据本发明的活性成分中的至少一种并且被选择用来适合既定目标和当时环境。

[0332] 在这些组合中,活性成分是以纯形式采用的,例如呈一个具体粒度的固体活性成分,或优选地与配制品领域中常规地使用的助剂中的至少一种一起,这些助剂例如增量剂,例如溶剂或固体载体,或例如表面活性化合物(表面活性剂)。

[0333] 适合的溶剂的实例是:未氢化的或部分氢化的芳香族烃,优选C₈至C₁₂的烷基苯部分,例如二甲苯混合物、烷基化的萘或四氢化萘、脂肪族的或脂环族的烃,例如石蜡或环己烷,醇类如乙醇、丙醇或丁醇、乙二醇及它们的醚类和酯类如丙二醇、二丙二醇醚、乙二醇或乙二醇单甲醚或己二醇单乙醚,酮类,例如环己酮、异佛尔酮或双丙酮醇,强极性溶剂,例如N-甲基吡咯烷-2-酮、二甲亚砜或N,N-二甲基甲酰胺、水,未环氧化的或环氧化的植物油,例如未环氧化的或环氧化的菜籽油、蓖麻油、椰子油或大豆油和硅油。

[0334] 用于例如尘剂和可分散性粉剂的固体载体通常是经研磨的天然矿物,例如方解石、滑石、高岭土、蒙脱石或凹凸棒石。为了改良物理性质,添加高度分散的硅石或高度分散的吸收性聚合物也是可能的。用于颗粒剂的合适的吸附性载体是多孔型的,例如浮石、砖砾、海泡石或膨润土,并且合适的非吸附性载体材料是方解石或沙。此外,可以使用大量无机或有机天然物的粒化材料,特别是白云石或粉碎的植物残余料。

[0335] 取决于待配制的活性成分的类型,合适的表面活性化合物是非离子型、阳离子型和/或阴离子型表面活性剂或表面活性剂混合物,它们具有良好的乳化、分散以及湿润特性。如下所列的表面活性剂应仅看作实例;许多制剂领域常用的并且适用于本发明的其他表面活性剂描述于相关文献中。

[0336] 合适的非离子型表面活性剂尤其是脂肪族或环脂肪族醇、饱和或不饱和脂肪酸或烷基酚的聚乙二醇醚衍生物,这些衍生物可以包括约3个到约30个乙二醇醚基团并且在(环)脂肪族烃基团中的约8个到约20个碳原子或在烷基酚的烷基部分中的约6个到约18个碳原子。也合适的是水溶性聚氧化乙烯与聚丙二醇、乙二氨基聚丙二醇或烷基聚丙二醇的加合物,这些加合物具有在烷基链中的1个到约10个碳原子和约20个到约250个乙二醇醚基团以及约10个到约100个丙二醇醚基团。通常,以上提及的化合物包括每聚乙二醇单元1个到约5个乙二醇单元。可以提及的实例是壬苯氧基聚乙氧基乙醇(nonylphenoxypolyethoxyethanol)、蓖麻油聚乙二醇醚、聚丙二醇/聚环氧乙烷加合物、三丁基苯氧基聚乙氧基乙醇、聚乙二醇或辛基苯氧基聚乙氧基乙醇。也合适的是聚氧基乙烯脱水山梨醇的脂肪酸酯,例如聚氧基乙烯脱水山梨醇三油酸酯。

[0337] 阳离子型表面活性剂尤其是季铵盐,这些季铵盐总体上具有至少一个烷基,该烷基中约8个到约22个C原子作为取代基并且作为进一步取代基(未卤化或卤化)低碳数烷基或羟基烷基或苄基。这些盐优选是以卤化物、甲基硫酸盐或乙基硫酸盐的形式。实例是硬脂酰基三甲基氯化铵和苄基双(2-氯乙基)乙基溴化铵。

[0338] 适宜的阴离子型表面活性剂的实例是水溶性皂类或水溶性合成的表面活性化合物。合适的皂类的实例是具有约10个到约22个C原子的脂肪酸的碱金属盐、碱土金属盐或(未被取代的或被取代的)铵盐,例如油酸或硬脂酸的钠盐或钾盐、或例如从椰子或妥尔油可获得的天然脂肪酸混合物的钠盐或钾盐;还必须提及的是脂肪酸甲基牛磺酸盐。然而,更常用的是合成的表面活性剂,特别是脂肪磺酸盐、脂肪硫酸盐、磺化的苯并咪唑衍生物或烷基芳基磺酸盐。通常,脂肪磺酸盐和脂肪硫酸盐是以碱金属盐、碱土金属盐或(被取代或未

被取代的) 铵盐形式存在的并且这些盐总体上具有约8个到约 22个C原子的烷基, 烷基也应该理解为包括酰基的烷基部分; 可以提及的实例是木质素磺酸、十二烷基硫酸酯或从天然脂肪酸制备的脂肪醇硫酸酯混合物的钠盐或钙盐。该组还包括脂肪醇/环氧乙烷加合物的硫酸酯盐和磺酸盐。这些磺化的苯并咪唑衍生物优选地包含2个磺酰基基团和具有约8到约22个 C原子的脂肪酸残基。烷基芳基磺酸盐的实例是癸基苯磺酸、二丁基萘磺酸或萘磺酸/甲醛缩合物的钠盐、钙盐或三乙醇铵盐。此外, 还可能的是适合的磷酸盐, 例如对壬基苯酚/(4-14) 环氧乙烷加合物的磷酸酯盐, 或磷脂盐。

[0339] 通常情况下, 这些组合物包括0.1%到99% (尤其是0.1%到95%) 的活性成分以及1%到99.9% (尤其是5%到99.9%) 的至少一种固体或液体佐剂, 原则上可能的是该组合物的0到25% (尤其是0.1%到20%) 为表面活性剂 (在每种情况下%表示重量百分比)。尽管对于商品而言, 浓缩的组合物通常是优选的, 但是终端用户通常使用具有实质上更低浓度的活性成分的稀释组合物。

[0340] 典型地, 用于叶施用的预混配制品包括0.1%至99.9%, 尤其是1%至 95%的所希望的成分, 以及99.9%至0.1%, 尤其是99%至5%的固体或液体佐剂 (包括例如一种溶剂, 例如水), 其中这些助剂可以是一种表面活性剂, 其量基于该预混配制品是0至50%, 尤其是0.5%至40%。

[0341] 通常, 用于种子处理施用的桶混配制品包括0.25%至80%, 尤其是1%至75%的所希望的成分, 以及99.75%至20%, 尤其是99%至25%的固体或液体助剂 (包括例如一种溶剂, 如水), 其中这些助剂可以是一种表面活性剂, 其量基于该桶混配制品是0至40%, 尤其是0.5%至30%。

[0342] 典型地, 用于种子处理施用的预混配制品包括0.5%至99.9%, 尤其是 1%至95%的所希望的成分, 以及99.5%至0.1%, 尤其是99%至5%的固体或液体佐剂 (包括例如一种溶剂, 例如水), 其中这些助剂可以是一种表面活性剂, 其量基于该预混配制品是0至50%, 尤其是0.5%至40%。

[0343] 而商用的产品优选地被配制为浓缩物 (例如, 预混组合物 (配制品)), 最终使用者通常使用稀释的配制品 (例如, 储箱混合组合物)。

[0344] 优选的种子处理预混配制品是水性悬浮液浓缩物。该配制品可以使用常规的处理技术以及机器, 例如流化床技术、滚筒研磨方法、静态转动 (rotostatic) 种子处理器以及转鼓包衣器施用到种子上。其他方法, 例如喷出床也可以是有用的。这些种子可以在包衣之前进行预上浆。包衣之后, 将这些种子典型地进行干燥并且然后转移到一个上浆机器中用于上浆 (sizing)。这样的方法在本领域中是熟知的。

[0345] 总体上, 本发明的预混组合物包括按质量计0.5%至99.9%, 尤其是1%至95%, 有利地1%至50%的所希望的成分, 以及按质量计99.5%至0.1%, 尤其是99%至5%的固体或液体佐剂 (包括例如一种溶剂, 例如水), 其中这些助剂 (或佐剂) 可以是一种表面活性剂, 其量基于该预混配制品是按质量计0至50%, 尤其是0.5%至40%。

[0346] 用于预混组合物的叶配制品类型的实例是:

[0347] GR: 颗粒剂

[0348] WP: 可湿性粉剂

[0349] WG: 水可分散颗粒 (粉末) 剂

- [0350] SG:水溶性颗粒剂
- [0351] SL:可溶的浓缩物
- [0352] EC:可乳化的浓缩物
- [0353] EW:乳液,水包油
- [0354] ME:微乳液
- [0355] SC:水性悬浮液浓缩物
- [0356] CS:水性胶囊悬浮液
- [0357] OD:基于油的悬浮液浓缩物,以及
- [0358] SE:水性悬乳液。
- [0359] 而用于预混组合物的种子处理配制品类型的实例是:
- [0360] WS:用于种子处理浆料的可湿性粉剂
- [0361] LS:用于种子处理的溶液
- [0362] ES:用于种子处理的乳液
- [0363] FS:用于种子处理的悬浮液浓缩物
- [0364] WG:水可分散颗粒剂,以及
- [0365] CS:水性胶囊悬浮液。
- [0366] 适合于桶混组合物的配制品类型的例子是溶液、稀释乳液、悬浮液或其混合物、以及尘剂。
- [0367] 特别地,优选的组合物组成如下(%=重量百分比):
- [0368] 可乳化的浓缩物:
- [0369] 活性成分:1%至95%,优选5%至20%
- [0370] 表面活性剂:1%至30%,优选10%至20%
- [0371] 溶剂:5%至98%,优选70%至85%
- [0372] 尘剂:
- [0373] 活性成分:0.1%至10%,优选0.1%至1%
- [0374] 固体载体:99.9%至90%,优选99.9%至99%
- [0375] 悬浮液浓缩物:
- [0376] 活性成分:5%至75%,优选10%至50%
- [0377] 水:94%到24%,优选88%到30%
- [0378] 表面活性剂:1%至40%,优选2%至30%
- [0379] 可湿性粉剂:
- [0380] 活性成分:0.5%至90%,优选1%至80%
- [0381] 表面活性剂:0.5%至20%,优选1%至15%
- [0382] 固体载体:5%到99%,优选地15%到98%
- [0383] 颗粒剂:
- [0384] 活性成分:0.5%至30%,优选3%至15%
- [0385] 固体载体:99.5%到70%,优选97%到85%
- [0386] 制备实例:
- [0387] “M.p.”是指以℃计的熔点。自由基表示甲基基团。

[0388] LCMS方法:

[0389] 方法G-标准:

[0390] 在来自沃特斯的质谱仪 (SQD或ZQ单四极杆质谱仪) 上记录光谱, 该质谱仪配备有电喷射源 (极性: 正离子或负离子, 毛细管: 3.00kV, 锥孔范围 (Cone range): 30V-60V, 萃取器: 2.00V, 源温度: 150℃, 去溶剂化温度: 350℃, 锥孔气体流量: 0L/Hr, 去溶剂化气体流量: 650L/Hr; 质量范围: 100Da至900Da) 以及一个来自沃特斯的Acquity UPLC: 二元泵、加热管柱室以及二极管阵列检测器)。溶剂脱气装置, 二元泵, 加热柱室以及二极管阵列检测器。柱: 沃特斯UPLC HSS T3, 1.8μm, 30x 2.1mm, 温度: 60℃, DAD波长范围 (nm): 210至500, 溶剂梯度: A=水+5% MeOH+0.05% HCOOH, B=乙腈+0.05% HCOOH; 梯度: 梯度: 0min 0% B, 100%A; 1.2-1.5min 100%B; 流量 (ml/min) 0.85

[0391] 方法H-标准长:

[0392] 光谱记录在来自沃特斯公司的质谱仪 (SQD或ZQ单四极杆质谱仪) 上, 其装备有电喷射源 (极性: 正离子或负离子, 毛细管: 3.00kV, 锥孔范围: 30V-60V, 萃取器: 2.00V, 源温度: 150℃, 去溶剂化温度: 350℃, 锥孔气体流量: 0L/Hr, 去溶剂化气体流量: 650L/Hr; 质量范围: 100Da至900Da) 以及来自沃特斯的Acquity UPLC: 二元泵、加热管柱室以及二极管阵列检测器。溶剂脱气装置, 二元泵, 加热柱室以及二极管阵列检测器。柱: 沃特斯UPLC HSS T3, 1.8μm, 30x 2.1mm, 温度: 60℃, DAD波长范围 (nm): 210至500, 溶剂梯度: A=水+5% MeOH+0.05% HCOOH, B = 乙腈+0.05% HCOOH; 梯度: 梯度: 0min 0%B, 100%A; 2.7-3.0min 100% B; 流量 (ml/min) 0.85

[0393] 方法I-非极性:

[0394] 在来自沃特斯的质谱仪 (SQD或ZQ单四极杆质谱仪) 上记录光谱, 该质谱仪配备有电喷射源 (极性: 正离子或负离子, 毛细管: 3.00kV, 锥孔范围 (Cone range): 30V-60V, 萃取器: 2.00V, 源温度: 150℃, 去溶剂化温度: 350℃, 锥孔气体流量: 0L/Hr, 去溶剂化气体流量: 650L/Hr; 质量范围: 100Da至900Da) 以及一个来自沃特斯的Acquity UPLC: 二元泵、加热管柱室以及二极管阵列检测器)。溶剂脱气装置, 二元泵, 加热柱室以及二极管阵列检测器。柱: 沃特斯UPLC HSS T3, 1.8μm, 30x 2.1mm, 温度: 60℃, DAD波长范围 (nm): 210至500, 溶剂梯度: A=水+5% MeOH+0.05% HCOOH, B=乙腈+0.05% HCOOH; 梯度: 梯度: 0min 40%B, 60% A; 1.2-1.5min 100%B; 流量 (ml/min) 0.85

[0395] 质谱方法MS

[0396] 来自岛津 (Shimadzu) 的LC-20AD质谱仪 (单四极质谱仪)

[0397] 仪器参数:

[0398] 离子化方法: 电喷射

[0399] 极性: 正离子和负离子

[0400] 毛细管 (kV) 1.50

[0401] 锥孔 (V) 未知

[0402] 萃取器 (V) 5.00

[0403] 源温度 (°C) 200

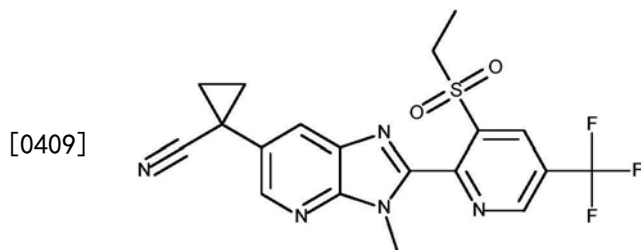
[0404] 脱溶剂温度 (°C) 250

[0405] 锥孔反吹气流 (l/Hr) 90

[0406] 脱溶剂气流 (1/Hr) 90

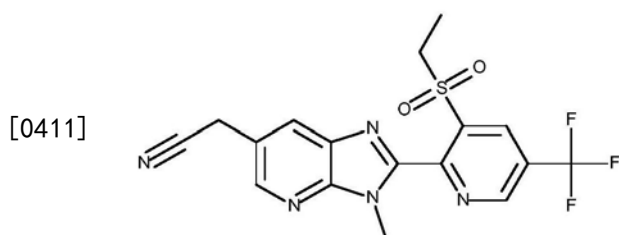
[0407] 质量范围: 50Da 至 1000Da

[0408] 实例P1: 1-[2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶-6-基]环丙烷甲腈 (化合物5.002)



(化合物 5.002)

[0410] 步骤A: 2-[2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶-6-基]乙腈:

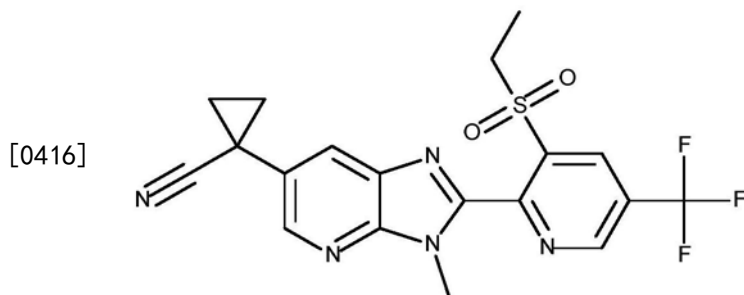


[0412] 向含有 2.2ml DMF 的 2mL-5mL 微波瓶中添加三(二苯亚甲基丙酮)二钯 (0) (11mg, 0.11mmol)、氟化锌 (II) (69mg, 0.67mmol)、4,5-双(二苯基磷基)-9,9-二甲基咕吨 (Xantphos, 13mg, 0.022mmol)、2-三甲基甲硅烷基乙腈 (150mg, 1.3mmol) 和 6-溴-2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶 (500mg, 1.1mmol, 如在 WO 2013018928 中描述的进行制备)。将盖密封并将混合物在微波中加热至 140°C 持续 30 分钟。在这时之后, LCMS 分析显示反应完成。将混合物冷却并用叔丁基甲基醚稀释, 用水洗涤并且然后用盐水洗涤, 并将有机层经无水 Na2SO4 干燥, 过滤并在真空中浓缩。将粗棕色残余物经硅胶筒 (Rf 200) 纯化, 用环己烷/乙酸乙酯洗脱, 以给出呈米色粉末状的标题产物。

[0413] HPLC 0.87 (方法 G), 0.87mins (MH+ (410))。

[0414] $^1\text{H NMR}$ (400Mhz, 氯仿-d) δ ppm; 1.45 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H); 3.94 (s, 3H); 3.97-4.05 (m, 4H); 8.16 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H) 8.49 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H) 8.81 (d, $J=1.83\text{Hz}$, 1H) 9.27 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H)。

[0415] 步骤B: 1-[2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶-6-基]环丙烷甲腈 (化合物5.002);

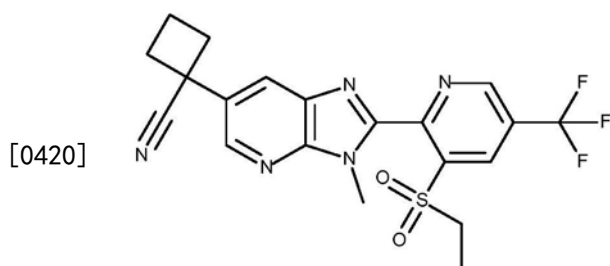


[0417] 向 2-[2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶-

6-基]乙腈(300mg,0.73mmol)在乙腈(10ml)中的溶液中添加碳酸铯(720mg,2.20mmol)和1,2-二溴乙烷(280mg,1.50mmol)。将棕色溶液在环境温度下搅拌1小时并然后加热至70℃。LC/MS显示1小时后形成所需产物。将反应冷却并允许在环境温度下搅拌另外的4天,并然后用乙酸乙酯和水稀释,将有机层分离,并依次用水和盐水洗涤,经Na₂SO₄干燥,过滤并在真空中浓缩。将粗混合物经硅胶筒(Rf200)纯化,用环己烷/乙酸乙酯洗脱,以给出呈黄色树脂的标题化合物。

[0418] LCMS(方法G) Rt.0.94min, 436 (M+H)。¹H NMR(400MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.44 (t, J=7.52Hz, 3H); 1.52-1.57 (m, 2H); 1.70 (br. s., 1H); 1.83-1.89 (m, 2H); 4.01 (q, J=7.46Hz, 2H); 8.08 (d, J=2.20Hz, 1H); 8.56 (d, J=1.83Hz, 1H); 8.80 (d, J=1.83Hz, 1H); 9.26 (d, J=1.10Hz, 1H)。

[0419] 实例P2:1-[2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶-6-基]环丁烷甲腈(化合物编号7.002):

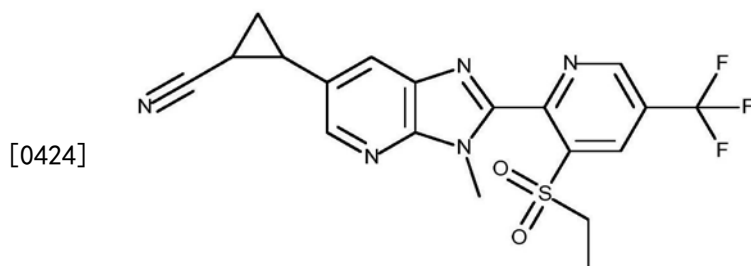


(化合物 7.002)

[0421] 在氩气下,将2-[2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶-6-基]乙腈(如在实例P1,步骤A中制备的,200mg,0.49 mmol)的溶液溶解于二甲基甲酰胺中并冷却至0℃。向此溶液中添加氢化钠(47mg,55%在矿物油中,因此25mg,1.1mmol)并将反应混合物在0℃下搅拌30分钟,并然后用1,3-二溴丙烷(200mg,0.98mmol)处理。将棕色反应混合物在冰浴冷却下搅拌1小时,并且然后允许升温至环境温度并搅拌18小时。将混合物用饱和的水性NH₄Cl(放热反应,温度升高至35℃)淬灭并用叔丁基甲基醚萃取(x3)。将合并的有机层依次用水和盐水洗涤,经Na₂SO₄干燥,过滤并在真空中浓缩。经粗产物经硅胶筒(Rf200)纯化,用环己烷/乙酸乙酯洗脱,以给出呈无色树脂的标题化合物。

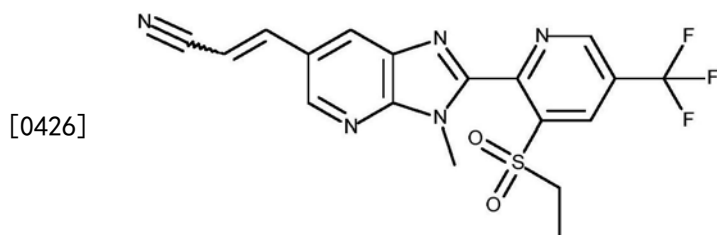
[0422] LCMS(方法G); Rt=0.98min, (M+H) 450。¹H NMR(400Mhz, 氯仿-d) δ ppm: 1.42 (t, J=7.34Hz, 3H); 2.12-2.25 (m, 1H); 2.45-2.62 (m, 1H); 2.69- 2.81 (m, 2H); 2.90-3.07 (m, 2H); 3.95 (s, 3H); 4.00 (q, J=7.34Hz, 2H); 8.11 (d, J=2.20Hz, 1H); 8.61 (d, J=2.20Hz, 1H); 8.78 (d, J=2.20Hz, 1H) 9.24 (dd, J=2.20, 0.73Hz, 1H)。

[0423] 实例P3.2-[2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶-6-基]环丙烷甲腈(化合物编号5.007)。



(化合物编号 5.007)

[0425] 步骤A: (E,Z)-3-[2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶-6-基]丙-2-烯腈

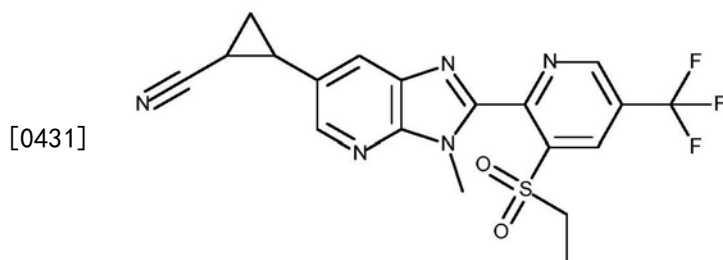


[0427] 将(E)-3-[2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶-6-基]丙-2-烯腈(0.5g,1.1mmol)溶解于DMF(1.5ml)中并用丙烯腈(240mg,4.5mmol)处理。将反应用氩气冲洗并然后添加N-乙基-N-异丙基-丙-2-胺、三(邻-甲苯基)膦(62mg,0.2mmol)和乙酸钡(II)(23mg,0.1mmol)。将棕色溶液在120℃下搅拌过夜。

[0428] 在14小时之后,再次添加相同量的乙酸钡(II)和三(邻-甲苯基)膦并将混合物在120℃下搅拌另外的14小时。在此时间之后允许该反应混合物冷却至环境温度并用乙酸乙酯和水稀释。分离有机层,再次用水洗涤并用盐水洗涤一次,经Na₂SO₄干燥,过滤并在真空中浓缩。将粗产物经硅胶筒(Rf200)纯化。用环己烷:乙酸乙酯洗脱,以给出呈米色固体的标题化合物(3:1E/Z异构体混合物)。

[0429] LCMS(方法G);Rt=0.93min,(M+H)422。

[0430] 步骤B:2-[2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶-6-基]环丙烷甲腈(实例5.007)。

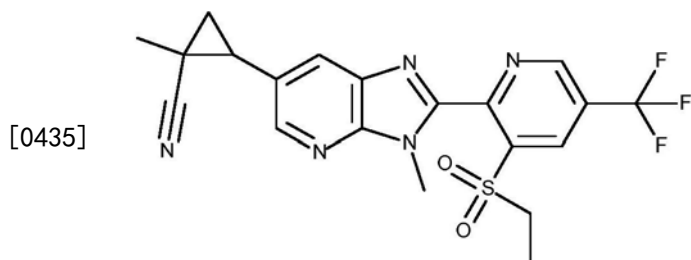


[0432] 将碘化三甲氧化硫(760mg,3.3mmol)悬浮在4ml DMSO中并用氢化钠(130mg的55%在矿物油中的悬浮液,因此71mg,3.0mmol)处理。在室温下,将混合物搅拌45分钟,并然后向该悬浮液中缓慢地添加在3ml DMSO中的2-[2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶-6-基]乙腈(280mg,0.66mmol)。将所得红色溶液在室温下搅拌。2小时后的LC/MS分析在0.69分钟检测到期望的质量,并且在0.94分钟检测到起始材料。允许该反应混合物搅拌过夜并然后用水性饱和的NH₄Cl淬灭并用EtOAc萃取(X3)。将合并的有机层用盐水洗涤一次,经Na₂SO₄干燥,过滤并在真空下浓缩。经粗反应混合物经硅胶筒(Rf200)纯化,用环己烷/EtOAc洗脱以给出两种产物,将该两种产物进一步通过反相色谱法进行纯化。这产生作为第一洗脱化合物的标题化合物:

[0433] LCMS(方法G);Rt=0.89min,(M+H)436,Rt=0.89。¹H NMR(400 MHz,氯仿-d)δppm:1.40(t,J=7.34Hz,3H);1.61-1.72(m,2H);1.98(td,J=8.44,5.87Hz,1H);2.69-2.78(m,1H);3.92(s,3H);3.93-4.10(m,2H);7.97(d,J=1.47Hz,1H);8.54(d,J=2.20Hz,1H);8.77(d,J=1.47Hz,1H);9.22(d,J=1.47Hz,1H);

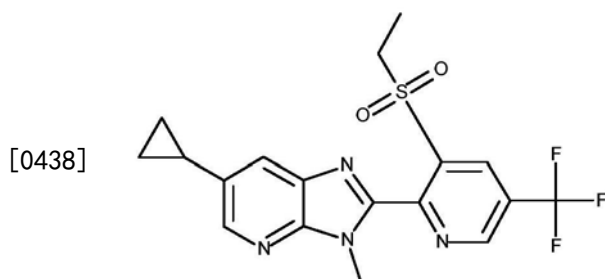
[0434] 将被鉴定为2-[2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,

5-b]吡啶-6-基]-1-甲基-环丙烷甲腈(化合物P5表A1)的第二产物洗脱:



[0436] LCMS(方法G);R.t=0.91min,(M+H)⁻CH₃,436.¹H NMR(400Mhz, 氯仿-d) δppm 1.40(t,J=7.52Hz,3H) 1.53-1.61(m,3H) 1.63-1.70(m,1H) 1.76(dt,J=9.35,5.41Hz,1H) 3.89(s,3H) 3.97(q,J=7.34Hz,2H) 7.75-7.80(m, 1H) 8.42(d,J=1.83Hz,1H) 8.77(d,J=2.20Hz,1H) 9.19-9.26(m,1H)。

[0437] 实例P4:6-环丙基-2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶(化合物5.001)



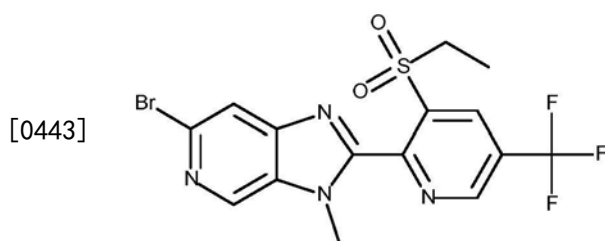
(化合物 5.001)

[0439] 将6-溴-2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-b]吡啶(500mg,1.1mmol,如在W0 2013/018928中描述的制备)、环丙基三氟硼酸钾(300mg,2.2mmol)、双(三-叔丁基膦)钯(0)(23mg,0.045mmol)和碳酸钠(170mg,1.6mmol)溶解于二甲氧基乙烷中。将反应混合物转移至微波瓶中并在140℃下加热80分钟。

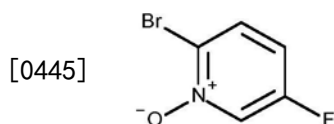
[0440] 然后允许该反应混合物冷却并用水和乙酸乙酯稀释。分离有机层,用水和盐水洗涤,经Na₂SO₄干燥,过滤并在真空中浓缩。将粗产物溶解于二氯甲烷中并将其放置于吸附在teflon bulk吸附剂上,然后将其经硅胶筒(Rf200)纯化用环己烷/乙酸乙酯洗脱,并然后通过制备型RP HPLC,以给出呈白色固体的标题化合物。

[0441] LCMS(方法G);R.t=1.01min,(M+H)⁺,411;¹H NMR(400MHz,氯仿-d) δppm 0.67-0.73(m,2H) 0.96-1.02(m,2H) 1.32(t,J=7.34Hz,3H) 2.01(tt,J=8.48,5.09Hz,1H) 3.81(s,3H) 3.93(q,J=7.46Hz,2H) 7.61(d,J=1.83Hz,1H) 8.32(d,J=1.83Hz,1H) 8.67-8.69(m,1H) 9.13(dd,J=2.20,0.73Hz,1H)。

[0442] 中间体I-1:6-溴-2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-c]吡啶:

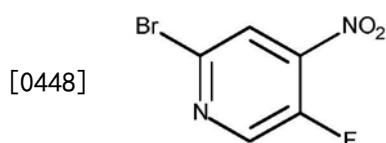


[0444] 步骤A:2-溴-5-氟-1-氧化-吡啶-1-鎓:



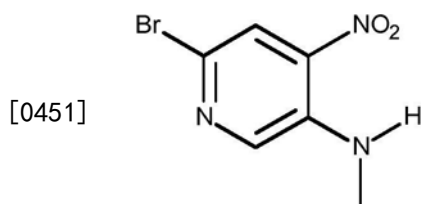
[0446] 在0℃下,向2-溴-5-氟吡啶(50.0g,0.284mol)在TFA(100.0mL)中的搅拌溶液中逐滴添加H₂O₂(30%,150mL),并且将该混合物在60℃-70℃下搅拌过夜。在冷却之后,将该反应混合物倾倒入冰-水上,用二氯甲烷/甲醇(10:1,500mL x 3)萃取,将有机层用饱和碳酸氢钠溶液和盐水洗涤,并用无水硫酸钠干燥。在过滤和在真空中浓缩之后,将粗产物(灰白色固体)不经进一步纯化用于下一步骤。

[0447] 步骤B:2-溴-5-氟-4-硝基-吡啶:



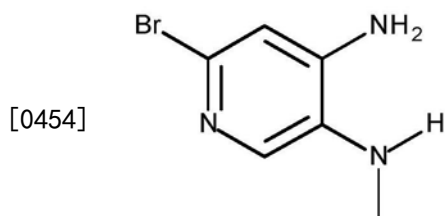
[0449] 在0℃下,向2-溴-5-氟-1-氧化-吡啶-1-鎓(46g,0.239mmol)在硫酸(浓)(200mL)中的溶液中缓慢添加发烟硝酸(100mL)。在添加之后,该反应温度升至120℃,并在此温度下继续搅拌8小时。在冷却至环境温度之后,将该反应溶液倾倒入冰-水上。用NH₄OH将pH值调整为1,用乙酸乙酯(400mL x 3)萃取,将有机层用饱和的碳酸氢钠溶液和盐水洗涤,并经无水硫酸钠干燥。在过滤以及在真空中浓缩之后,将粗产物通过柱色谱纯化以得到呈浅黄色固体的标题化合物。

[0450] 步骤C:6-溴-N-甲基-4-硝基-吡啶-3-胺:



[0452] 向2-溴-5-氟-4-硝基吡啶(15g,67.8mmol)在乙醇(100mL)中的溶液中添加30%MeNH₂/乙醇(60mL)。将反应混合物在环境温度下搅拌4小时。然后将该混合物在真空中浓缩,以给出呈固体状的标题化合物,将其不经进一步纯化用于下一步骤。

[0453] 步骤D:6-溴-N3-甲基-吡啶-3,4-二胺:(方法A)



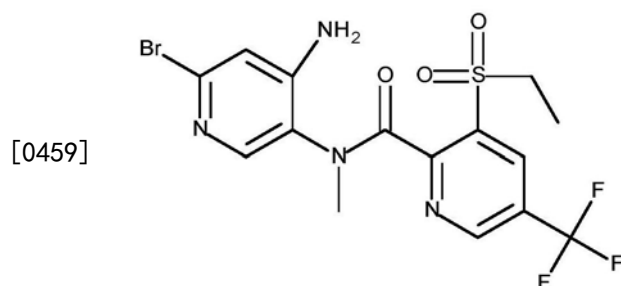
[0455] 向6-溴-N-甲基-4-硝基-吡啶-3-胺(14.9g,64.2mmol)在甲醇(150 mL)中的溶液中添加雷尼镍(Raney Ni)(20%wt),并然后在0℃下逐滴添加水合肼(25mL)。将该反应混合物在环境温度下搅拌1小时。将雷尼镍通过硅藻土过滤出;将滤液在真空中浓缩并通过硅胶柱色谱(用二氯甲烷:甲醇,10:1进行洗脱)纯化,以得到呈灰白色固体的标题化合物。¹H NMR (400MHz,DMSO-d₆):δ(ppm)7.20(s,1H),6.53(s,1H),5.76(brs,2H),4.81(q,1H),

2.70 (d, J=6.4Hz, 3H)。ESI-MS (+): 203 (M+H)。

[0456] (方法B)

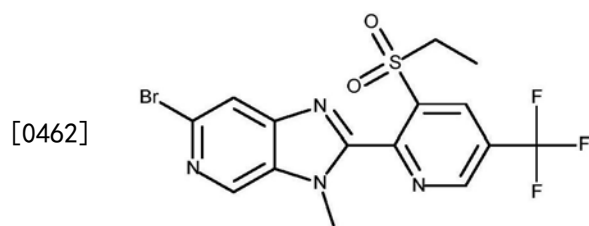
[0457] 在环境温度下,向6-溴-N-甲基-4-硝基-吡啶-3-胺 (20g, 86mmol) 在乙酸 (400ml) 中的溶液中添加Fe粉末 (24g, 428mmol)。将反应混合物在 80°C 下搅拌5小时。将固体通过硅藻土过滤出;将滤液通过使用水性NaOH调整至pH=4-5并然后用乙酸乙酯萃取。将有机层经无水MgSO₄干燥,过滤并在真空中浓缩。将残余物从乙酸乙酯再结晶,以得到呈灰白色固体的标题化合物。¹H NMR (400MHz, DMSO-d₆): δ (ppm) 7.20 (s, 1H), 6.53 (s, 1H), 5.76 (brs, 2H), 4.81 (q, 1H), 2.70 (d, J=6.4Hz, 3H)。ESI-MS (+): 203 (M+H)。

[0458] 步骤F: N-(4-氨基-6-溴-3-吡啶基)-3-乙基磺酰基-N-甲基-5-(三氟甲基)吡啶-2-甲酰胺:



[0460] 向6-溴-N3-甲基-吡啶-3,4-二胺 (0.60g, 2.96mmol)、3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)吡啶-2-甲酸 (0.92g, 3.26mmol, 如在WO 2013180194中制备的) 和HATU (1.4g, 3.68mmol) 在DMF (5.0mL) 中的搅拌溶液中添加 DIPEA (1.2ml, 7.26mmol)。将该系统在环境温度下搅拌过夜。将该反应用EtOAc和H₂O稀释,将有机层用盐水和水洗滌,用无水硫酸钠干燥。在过滤和在真空下浓缩之后,将该粗标题产物不经进一步纯化用于下一步骤。

[0461] 步骤G: 6-溴-2-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-3-甲基-咪唑并[4,5-c]吡啶 (化合物I-1):



(化合物 I-1)

[0463] 将N-(4-氨基-6-溴-3-吡啶基)-3-乙基磺酰基-N-甲基-5-(三氟甲基)吡啶-2-甲酰胺 (粗品, 2.96mmol) 于乙酸 (5.0mL) 中的溶液在120°C搅拌过夜。将该混合物蒸发至干燥。将残余物通过硅胶色谱法 (石油醚:EtOAc=4:1) 纯化,以给出呈白色固体的标题化合物。¹H NMR (400MHz, DMSO-d₆): δ (ppm) 9.53 (s, 1H), 8.94 (s, 1H), 8.74 (s, 1H), 8.01 (s, 1H), 3.83 (q, J=7.6Hz, 2H), 3.79 (s, 3H), 1.19 (t, J=7.2Hz, 3H)。¹⁹F NMR (300MHz, DMSO-d₆): δ (ppm) -60.42 (s, 3F)。ESI-MS (+): 449 (M+H), 472 (M+Na); ESI-MS (-): 447 (M-H)。Mpt. 188°C-190°C。LCMS (方法SQD13): Rt. 0.95min, 449/451 (M+H)。

[0464] 配制品实例 (% = 重量百分比)

	<u>实例 F1: 乳液浓缩物</u>	a)	b)	c)	
	活性成分	25%	40%	50%	
	十二烷基苯磺酸钙	5%	8%	6%	
	蓖麻油聚乙烯				
[0465]	乙二醇醚 (36 mol 的 EO)	5%	-	-	
	三丁基苯氧基聚乙二醇				
	醚 (30 mol 的 EO)	-	12%	4%	
	环己酮	-	15%	20%	
	二甲苯混合物	65%	25%	20%	
[0466]	任何所希望浓度的乳液可以从这些浓缩物通过用水稀释来制备。				
	<u>实例 F2: 溶液</u>	a)	b)	c)	d)
	活性成分	80%	10%	5%	95%
	乙二醇单甲				
	醚	20%	-	-	-
[0467]	聚乙二醇				
	MW 400	-	70%	-	-
	N-甲基吡咯烷-2-酮 -	20%	-	-	
	环氧化椰子油 -	-	1%	5%	
	石油醚				
	(沸程: 160°-190°)	-	-	94%	-
[0468]	这些溶液适合以微滴的形式使用。				
	<u>实例 F3: 颗粒</u>	a)	b)	c)	d)
	活性成分	5%	10%	8%	21%
[0469]	高岭土	94%	-	79%	54%
	高度分散的二氧化硅	1%	-	13%	7%
	凹凸棒石	-	90%	-	18%
[0470]	将该活性成分溶解于二氯甲烷中,将该溶液喷雾在一种或多种载体上并且随后将溶剂在真空下进行蒸发。				
	<u>实例 F4: 尘剂</u>	a)	b)		
	活性成分	2%	5%		
[0471]	高度分散的二氧化硅	1%	5%		
	滑石	97%	-		
	高岭土	-	90%		
[0472]	通过将载体与活性成分密切混合获得即用型尘剂。				
[0473]	<u>实例 F5: 可湿性粉剂</u>	a)	b)	c)	

	活性成分	25%	50%	75%
	木质素磺酸钠	5%	5%	-
	月桂基硫酸钠	3%	-	5%
	二异丁基-			
[0474]	萘磺酸钠	-	6%	10%
	辛基苯氧基聚乙二醇			
	醚 (7-8 mol 的 EO)	-	2%	-
	高度分散的二氧化硅	5%	10%	10%
	高岭土	62%	27%	-

[0475] 将活性成分与添加剂混合并且在合适的研磨机中充分地研磨该混合物。这给出了可湿性粉剂,这些可湿性粉剂可以用水进行稀释以给出任意的所希望的浓度的悬浮液。

实例 F6: 挤出机颗粒

	活性成分	10%
[0476]	木质素磺酸钠	2%
	羧甲基纤维素	1%
	高岭土	87%

[0477] 将活性成分与添加剂混合,并且研磨该混合物,用水湿润,挤出,粒化并在空气流中干燥。

实例 F7: 包衣颗粒

[0478]	活性成分	3%
	聚乙二醇 (MW 200)	3%
	高岭土	94%

[0479] 在混合器中,将精细研磨的活性成分均匀地施用到已经用聚乙二醇湿润的高岭土上。这给出了无尘的包衣颗粒。

实例 F8: 悬浮液浓缩物

	活性成分	40%
	乙二醇	10%
	壬基苯氧基聚乙二醇醚 (15 mol 的 EO)	6%
[0480]	木质素磺酸钠	10%
	羧甲基纤维素	1%
	37%甲醛水溶液	0.2%
	有机硅油 (75%水性乳液)	0.8%
	水	32%

[0481] 将精细研磨的活性成分与添加剂密切混合。任何希望浓度的悬浮液都可以从这样得到的悬浮液浓缩物通过用水稀释来制备。

<u>实例 F9: 干种子处理用的粉剂</u>		a)	b)	c)
[0482]	活性成分	25%	50%	75%
	轻质矿物油	5%	5%	5%
	高度分散的硅酸	5%	5%	-
	高岭土	65%	40%	-
	滑石	-	-	20%

[0483] 将该组合与这些佐剂充分混合并且将混合物在适当的研磨机中充分研磨,从而获得了可以直接用于种子处理的粉剂。

<u>实例 F10: 可乳化的浓缩物</u>		
[0484]	活性成分	10%
	辛酚聚乙二醇醚 (4 mol-5 mol 的环氧乙烷)	3%
	十二烷基苯磺酸钙	3%
	蓖麻油聚乙二醇醚 (35 mol 的环氧乙烷)	4%
	环己酮	30%
	二甲苯混合物	50%

[0485] 在植物保护中可以使用的具有任何所要求的稀释的乳液可以通过用水稀释从这种浓缩物中获得。

<u>实例 F11: 种子处理用的可流动性浓缩物</u>		
[0486]	活性成分	40%
	丙二醇	5%
	共聚物丁醇 PO/EO	2%
	三苯乙烯酚, 具有 10-20 摩尔 EO	2%
	1,2-苯并异噻唑啉-3-酮 (处于在水中 20%的溶液形式)	0.5%
	单偶氮-颜料钙盐	5%
	硅油 (处于在水中 75%的乳液的形式)	0.2%
	水	45.3%

[0487] 将这种精细研磨的组合与这些佐剂紧密地混合,从而给出了悬浮液浓缩物,可以使用水稀释从该浓缩物获得任何所希望稀释度的悬浮液。使用此类稀释体,可以对活的植物连同植物繁殖材料进行处理并且对其针对微生物侵染通过喷雾、倾倒或浸渍进行保护。

[0488] 通过添加其他有杀昆虫、杀螨和/或杀真菌活性的成分,根据本发明的这些组合物的活性可以显著地加宽,并且适合于当时的环境。具有化学式I的化合物与其他具有杀昆虫、杀螨和/或杀真菌活性的成分的混合物还可以具有进一步地、意料之外的优点,这些优点还可以在更宽的含义上描述为协同活性。例如,植物对其更好的耐受性、降低的植物毒性,昆虫可以在它们的不同发育阶段得到控制或者在它们的生产期间(例如,在研磨或者混合过程中,在它们的储藏或它们的使用过程中)更好的行为。

[0489] 在这里,合适的活性成分的添加物是例如下面类别的活性成分的代表物:有机磷

化合物、硝基苯酚衍生物、硫脲、保幼激素、甲脒、二苯甲酮衍生物、脲类、吡咯衍生物、氨基甲酸酯、拟除虫菊酯、氯化烃、酰基脲、吡啶基亚甲基氨基衍生物、大环内酯类、新烟碱以及苏云金芽孢杆菌制剂。

[0490] 以下具有化学式I的化合物与活性成分的混合物是优选的(缩写“TX”意为“选自下组的一种化合物,该组由描述于本发明的组 1至11以及表 A 1中的化合物组成”):

[0491] 一种佐剂,该佐剂选自由以下物质组成的组:石油(别名)(628)+TX,

[0492] 一种杀螨剂选自下组,该组由以下物质组成:1,1-二(4-氯苯基)-2-乙氧基乙醇(IUPAC名称)(910)+TX、2,4-二氯苯基苯磺酸酯(IUPAC/化学文摘名称)(1059)+TX、2-氟-N-甲基-N-1-萘乙酰胺(IUPAC名称)(1295)+TX、4-氯苯基苯基砒(IUPAC名称)(981)+TX、阿维菌素(1)+TX、灭螨醌(3)+TX、乙酰虫脒[CCN]+TX、氟丙菊酯(9)+TX、涕灭威(16)+TX、涕灭砒威(863)+TX、 α -氯氰菊酯(202)+TX、赛硫磷(870)+TX、磺胺螨酯[CCN]+TX、逐磷酰胺(872)+TX、胺吸磷(875)+TX、胺吸磷草酸氢盐(875)+TX、双甲脒(24)+TX、杀螨特(881)+TX、三氧化二砷(882)+TX、AVI 382(化合物代码)+TX、AZ 60541(化合物代码)+TX、益棉磷(44)+TX、保棉磷(45)+TX、偶氮苯(IUPAC名称)(888)+TX、三唑锡(46)+TX、偶氮磷(889)+TX、奔菌灵(62)+TX、苯噁磷(别名)[CCN]+TX、苯螨特(71)+TX、苯甲酸苄酯(IUPAC名称)[CCN]+TX、联苯胍酯(74)+TX、氟氯菊酯(76)+TX、乐杀螨(907)+TX、溴灭菊酯(别名)+TX、溴烯杀(918)+TX、溴硫磷(920)+TX、乙基溴硫磷(921)+TX、溴螨酯(94)+TX、噻嗪酮(99)+TX、丁酮威(103)+TX、丁酮砒威(104)+TX、丁基哒螨灵(别名)+TX、石硫合剂(IUPAC名称)(111)+TX、毒杀芬(941)+TX、氯灭杀威(943)+TX、甲萘威(115)+TX、克百威(118)+TX、三硫磷(947)+TX、CGA 50' 439(研究代码)(125)+TX、灭螨猛(126)+TX、杀螨醚(959)+TX、杀虫脒(964)+TX、杀虫脒盐酸盐(964)+TX、溴虫脒(130)+TX、杀螨醇(968)+TX、杀螨酯(970)+TX、敌螨特(971)+TX、毒虫畏(131)+TX、乙酯杀螨醇(975)+TX、伊托明(977)+TX、灭虫脒(978)+TX、丙酯杀螨醇(983)+TX、毒死蜱(145)+TX、甲基毒死蜱(146)+TX、虫螨磷(994)+TX、瓜菊酯I(696)+TX、瓜菊酯II(696)+TX、瓜叶菊素(696)+TX、四螨嗪(158)+TX、氯氰碘柳胺(别名)[CCN]+TX、蝇毒磷(174)+TX、巴豆酰甲苯胺(别名)[CCN]+TX、巴毒磷(1010)+TX、硫杂灵(1013)+TX、果虫磷(1020)+TX、丁氟螨酯(CAS登记号:400882-07-7)+TX、高效氯氟氰菊酯(196)+TX、三环锡(199)+TX、氯氰菊酯(201)+TX、DCPM(1032)+TX、DDT(219)+TX、田乐磷(1037)+TX、田乐磷-0(1037)+TX、田乐磷-S(1037)+TX、内吸磷(1038)+TX、内吸磷-甲基(224)+TX、内吸磷-0(1038)+TX、内吸磷-0-甲基(224)+TX、内吸磷-S(1038)+TX、内吸磷-S-甲基(224)+TX、内吸磷-S-甲基磺隆(demeton-S-methylsulphon)(1039)+TX、丁醚脒(226)+TX、氯亚胺硫磷(1042)+TX、二嗪农(227)+TX、抑菌灵(230)+TX、敌敌畏(236)+TX、二克磷(dicliphos)(别名)+TX、三氯杀螨醇(242)+TX、百治磷(243)+TX、除螨灵(1071)+TX、甲氟磷(1081)+TX、乐果(262)+TX、二活菌素(别名)(653)+TX、消螨酚(1089)+TX、消螨酚(dinex-diclexine)(1089)+TX、消螨通(269)+TX、敌螨普(270)+TX、敌螨普-4[CCN]+TX、敌螨普-6[CCN]+TX、邻敌螨消(1090)+TX、硝戊酯(1092)+TX、硝辛酯杀螨剂(1097)+TX、硝丁酯(1098)+TX、敌杀磷(1102)+TX、二苯砒(IUPAC名称)(1103)+TX、双硫仑(别名)[CCN]+TX、乙拌磷(278)+TX、DNOC(282)+TX、多芬纳普(dofenapyn)(1113)+TX、多拉菌素(别名)[CCN]+TX、硫丹(294)+TX、因毒磷(1121)+TX、EPN(297)+TX、乙酰氨基阿维菌素(别名)[CCN]+TX、乙硫磷(309)+TX、益硫磷(1134)+TX、乙螨唑(320)+TX、乙噻硫磷(1142)+TX、抗螨唑(1147)+TX、啶螨醚

(328)+TX、苯丁锡(330)+TX、苯硫威(337)+TX、甲氰菊酯(342)+TX、吡螨胺(别名)+TX、唑螨酯(345)+TX、芬螨酯(1157)+TX、芬催凡尼尔(fentrifanil)(1161)+TX、氰戊菊酯(349)+TX、氟虫腴(354)+TX、啞螨酯(360)+TX、氟佐隆(1166)+TX、氟螨噻(1167)+TX、氟螨脲(366)+TX、氟氰戊菊酯(367)+TX、联氟螨(1169)+TX、氟虫脲(370)+TX、氟氯苯菊酯(372)+TX、氟杀螨(1174)+TX、氟胺氰菊酯(1184)+TX、FMC 1137(研究代码)(1185)+TX、伐虫脒(405)+TX、伐虫脒盐酸盐(405)+TX、安果(1192)+TX、胺甲威(1193)+TX、 γ -六氯环己烷(430)+TX、果绿定(1205)+TX、苜螨醚(424)+TX、庚烯磷(432)+TX、十六环丙烷(IUPAC/化学文摘名称)(1216)+TX、噻螨酮(441)+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、水胺硫磷(别名)(473)+TX、异丙基0-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸酯(IUPAC名称)(473)+TX、伊维菌素(别名)[CCN]+TX、茚虫菊素I(696)+TX、茚虫菊素II(696)+TX、碘硫磷(1248)+TX、林丹(430)+TX、虱螨脲(490)+TX、马拉硫磷(492)+TX、丙螨氰(1254)+TX、灭蚜磷(502)+TX、二噻磷(1261)+TX、二甲噻蒎(别名)[CCN]+TX、虫螨畏(1266)+TX、甲胺磷(527)+TX、杀扑磷(529)+TX、灭虫威(530)+TX、灭多威(531)+TX、溴甲烷(537)+TX、速灭威(550)+TX、速灭磷(556)+TX、自克威(1290)+TX、米尔(557)+TX、米尔贝肟(别名)[CCN]+TX、丙胺氟(1293)+TX、久效磷(561)+TX、茂果(1300)+TX、莫西菌素(别名)[CCN]+TX、二溴磷(567)+TX、NC-184(化合物代码)+TX、NC-512(化合物代码)+TX、氟蚁灵(1309)+TX、尼可霉素(别名)[CCN]+TX、戊氰威(1313)+TX、戊氰威1:1氯化锌复合物(1313)+TX、NNI-0101(化合物代码)+TX、NNI-0250(化合物代码)+TX、氧化乐果(594)+TX、杀线威(602)+TX、异亚砷磷(1324)+TX、砷拌磷(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、对硫磷(615)+TX、氯菊酯(626)+TX、石油(别名)(628)+TX、芬硫磷(1330)+TX、稻丰散(631)+TX、甲拌磷(636)+TX、伏杀硫磷(637)+TX、硫环磷(1338)+TX、亚胺硫磷(638)+TX、磷胺(639)+TX、辛硫磷(642)+TX、甲基嘧啶磷(652)+TX、氯化松节油(传统名)(1347)+TX、浏阳霉素(别名)(653)+TX、丙氯诺(1350)+TX、丙溴磷(662)+TX、蜚虱威(1354)+TX、克螨特(671)+TX、强敌(673)+TX、残杀威(678)+TX、乙噻唑磷(1360)+TX、发果(1362)+TX、除虫菊酯I(696)+TX、除虫菊酯II(696)+TX、除虫菊酯(696)+TX、哒螨灵(699)+TX、哒嗪硫磷(701)+TX、啞螨醚(706)+TX、啞硫磷(1370)+TX、啞硫磷(711)+TX、啞硫磷(1381)+TX、R-1492(研究代码)(1382)+TX、RA-17(研究代码)(1383)+TX、鱼藤酮(722)+TX、八甲磷(1389)+TX、硫线磷(别名)+TX、司拉克丁(别名)[CCN]+TX、SI-0009(化合物代码)+TX、苏硫磷(1402)+TX、螺螨酯(738)+TX、甲螨酯(739)+TX、SSI-121(研究代码)(1404)+TX、舒非仑(别名)[CCN]+TX、氟虫胺(750)+TX、治螟磷(753)+TX、硫(754)+TX、SZI-121(研究代码)(757)+TX、氟胺氰菊酯(398)+TX、吡螨胺(763)+TX、TEPP(1417)+TX、叔丁威(别名)+TX、杀虫威(777)+TX、三氯杀螨砒(786)+TX、杀螨素(别名)(653)+TX、杀螨硫醚(1425)+TX、thiafenox(别名)+TX、抗虫威(1431)+TX、久效威(800)+TX、甲基乙拌磷(801)+TX、克杀螨(1436)+TX、苏云金素(别名)[CCN]+TX、威菌磷(1441)+TX、苯螨噻(1443)+TX、三唑磷(820)+TX、啞蚜威(triazuron)(别名)+TX、敌百虫(824)+TX、氯苯乙丙磷(1455)+TX、三活菌素(别名)(653)+TX、蚜灭磷(847)+TX、氟吡啶虫[CCN]以及YI-5302(复合代码)+TX,

[0493] 一种杀藻剂,该杀藻剂选自由以下物质组成的组:3-苯并[b]噻吩-2-基-5,6-二氢-1,4,2-噁噻嗪-4-氧化物[CCN]+TX、二辛酸铜(IUPAC名称)(170)+TX、硫酸铜(172)+TX、cybutryne[CCN]+TX、二氢萘醌(dichlone)(1052)+TX、双氯酚(232)+TX、茵多酸(295)+TX、三苯锡(fentin)(347)+TX、熟石灰[CCN]+TX、代森钠(nabam)(566)+TX、灭藻醌

(quinoclamine) (714)+TX、醌萘胺(quinonamid) (1379)+TX、西玛津(730)+TX、三苯锡乙酸盐(IUPAC名称)(347)和氢氧化三苯锡(IUPAC名称)(347)+TX,

[0494] 一种驱蠕虫剂,该驱蠕虫剂选自由以下物质组成的组:阿巴美丁(1)+TX、克芦磷酯(1011)+TX、多拉克汀(别名)[CCN]+TX、依马克丁(291)+TX、依马克丁苯甲酸酯(291)+TX、依立诺克丁(别名)[CCN]+TX、伊维菌素(别名)[CCN]+TX、米尔倍霉素(别名)[CCN]+TX、莫昔克丁(别名)[CCN]+TX、哌嗪[CCN]+TX、塞拉菌素(selamectin)(别名)[CCN]+TX、多杀菌素(737)和硫菌灵(thiophanate)(1435)+TX,

[0495] 一种杀鸟剂,该杀鸟剂选自由以下物质组成的组:氯醛糖(127)+TX、异狄氏剂(1122)+TX、倍硫磷(346)+TX、吡啶-4-胺(IUPAC名称)(23)和士的宁(745)+TX,

[0496] 一种杀细菌剂,该杀细菌剂选自由以下物质组成的组:1-羟基-1H-吡啶-2-硫酮(IUPAC名称)(1222)+TX、4-(喹啉啉-2-基氨基)苯磺酰胺(IUPAC名称)(748)+TX、8-羟基喹啉硫酸盐(446)+TX、溴硝醇(97)+TX、二辛酸铜(IUPAC名称)(170)+TX、氢氧化铜(IUPAC名称)(169)+TX、甲酚[CCN]+TX、双氯酚(232)+TX、双吡硫翁(1105)+TX、多地辛(1112)+TX、敌磺钠(fenaminosulf)(1144)+TX、甲醛(404)+TX、汞加芬(别名)[CCN]+TX、春雷霉素(483)+TX、春雷霉素盐酸盐水合物(483)+TX、二(二甲基二硫代氨基甲酸盐)镍(IUPAC名称)(1308)+TX、三氯甲基吡啶(nitrapyrin)(580)+TX、辛噻酮(octhilinone)(590)+TX、奥索利酸(606)+TX、土霉素(611)+TX、羟基喹啉硫酸钾(446)+TX、烯丙苯噻唑(probenazole)(658)+TX、链霉素(744)+TX、链霉素倍半硫酸盐(744)+TX、叶枯酞(766)+TX扣硫柳汞(别名)[CCN]+TX,

[0497] 一种生物试剂,该生物试剂选自由以下物质构成的组:棉褐带卷蛾颗粒体病毒(Adoxophyes orana GV)(别名)(12)+TX、放射形土壤杆菌(别名)(13)+TX、捕食螨(Amblyseius spp.)(别名)(19)+TX、芹菜夜蛾核多角体病毒(Anagrapha falcifera NPV)(别名)(28)+TX、Anagrus atomus(别名)(29)+TX、蚜虫寄生蜂(Aphelinus abdominalis)(别名)(33)+TX、棉蚜寄生蜂(Aphidius colemani)(别名)(34)+TX、食蚜瘦蚊(Autographa californica NPV)(别名)(35)+TX、苜蓿银纹夜蛾核多角体病毒(Bacillus firmus)(别名)(38)+TX、坚强芽孢杆菌(Bacillus firmus)(别名)(48)+TX、球形芽孢杆菌(Bacillus sphaericus Neide)(学名)(49)+TX、苏云金芽孢杆菌(Bacillus thuringiensis Berliner)(学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌.I(Bacillus thuringiensis subsp.aizawai)(学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌以色列亚种(Bacillus thuringiensis subsp.israelensis)(学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌日本亚种(Bacillus thuringiensis subsp.japonensis)(学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌k.(Bacillus thuringiensis subsp.kurstaki)(学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌t.(Bacillus thuringiensis subsp.tenebrionis)(学名)(51)+TX、球孢白僵菌(Beauveria bassiana)(别名)(53)+TX、布氏白僵菌(Beauveria brongniartii)(别名)(54)+TX、草蜻蛉(Chrysoperla carnea)(别名)(151)+TX、孟氏隐唇瓢虫(Cryptolaemus montrouzieri)(别名)(178)+TX、苹果蠹蛾颗粒体病毒(Cydia pomonella GV)(别名)(191)+TX、西伯利亚离颚茧蜂(Dacnusa sibirica)(别名)(212)+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂(Diglyphus isaea)(别名)(254)+TX、丽蚜小蜂(Encarsia formosa)(学名)(293)+TX、桨角蚜小蜂(Eretmocerus eremicus)(别名)(300)+TX、玉米穗夜蛾核多角体病毒(Helicoverpa zea NPV)(别名)(431)+TX、嗜菌异小杆

线虫 (*Heterorhabditis bacteriophora*) 和 *H. megidis* (别名) (433) +TX、会聚长足瓢虫 (*Hippodamia convergens*) (别名) (442) +TX、橘粉介壳虫寄生蜂 (*Leptomastix dactylopii*) (别名) (488) +TX、盲蝽 (*Macrolophus caliginosus*) (别名) (491) +TX、甘蓝夜蛾核多角体病毒 (*Mamestra brassicae* NPV) (别名) (494) +TX、*Metaphycus helvolus* (别名) (522) +TX、黄绿绿僵菌 (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) (学名) (523) +TX、金龟子绿僵菌小孢变种 (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) (学名) (523) +TX、松黄叶蜂 (*Neodiprion sertifer*) 核多角体病毒和红头松树叶蜂 (*N. lecontei*) 核多角体病毒 (别名) (575) +TX、小花蝽 (别名) (596) +TX、玫烟色拟青霉 (*Paecilomyces fumosoroseus*) (别名) (613) +TX、智利捕植螨 (*Phytoseiulus persimilis*) (别名) (644) +TX、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua multicapsid*) 多核衣壳核多角体病毒 (学名) (741) +TX、毛蚊线虫 (*Steinernema bibionis*) (别名) (742) +TX、小卷蛾斯氏线虫 (*Steinernema carpocapsae*) (别名) (742) +TX、夜蛾斯氏线虫 (别名) (742) +TX、*Steinernema glaseri* (别名) (742) +TX、*Steinernema riobrave* (另名) (742) +TX、*Steinernema riobravise* (别名) (742) +TX、*Steinernema scapterisci* (别名) (742) +TX、斯氏线虫属 (*Steinernema* spp.) (别名) (742) +TX、赤眼蜂属 (别名) (826) +TX、西方盲走螨 (*Typhlodromus occidentalis*) (别名) (844) 和蜡蚧轮枝菌 (*Verticillium lecanii*) (别名) (848) +TX,

[0498] 一种土壤消毒剂,该土壤消毒剂选自由以下物质组成的组:碘甲烷 (IUPAC名称) (542) 和甲基溴 (537) +TX,

[0499] 一种化学不育剂,该化学不育剂选自由以下物质组成的组:啞磷嗪 (apholate) [CCN]+TX、双(氮丙啶)甲氨基磷硫化物 (bisazir) (别名) [CCN]+TX、白消安 (别名) [CCN]+TX、除虫脲 (250) +TX、迪麦替夫 (dimatif) (别名) [CCN]+TX、六甲蜜胺 (hemel) [CCN]+TX、六甲磷 (hempa) [CCN]+TX、甲基涕巴 (metepa) [CCN]+TX、甲硫涕巴 (methiotepa) [CCN]+TX、不育特 (methyl apholate) [CCN]+TX、不孕啶 (morzid) [CCN]+TX、氟幼脲 (penfluron) (别名) [CCN]+TX、涕巴 (tepa) [CCN]+TX、硫代六甲磷 (thiohempa) (别名) [CCN]+TX、硫涕巴 (别名) [CCN]+TX、曲他胺 (别名) [CCN] 和尿烷亚胺 (别名) [CCN] +TX,

[0500] 一种昆虫信息素,该昆虫信息素选自由以下物质组成的组:(E)-癸-5-烯-1-基乙酸酯与(E)-癸-5-烯-1-醇 (IUPAC名称) (222) +TX、(E)-十三碳-4-烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名称) (829) +TX、(E)-6-甲基庚-2-烯-4-醇 (IUPAC名称) (541) +TX、(E,Z)-十四碳-4,10-二烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名称) (779) +TX、(Z)-十二碳-7-烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名称) (285) +TX、(Z)-十六碳-11-烯醛 (IUPAC名称) (436) +TX、(Z)-十六碳-11-烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名称) (437) +TX、(Z)-十六碳-13-烯-11-炔-1-基乙酸酯 (IUPAC名称) (438) +TX、(Z)-二十-13-烯-10-酮 (IUPAC名称) (448) +TX、(Z)-十四碳-7-烯-1-醛 (IUPAC名称) (782) +TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-醇 (IUPAC名称) (783) +TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名称) (784) +TX、(7E,9Z)-十二碳-7,9-二烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名称) (283) +TX、(9Z,11E)-十四碳-9,11-二烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名称) (780) +TX、(9Z,12E)-十四碳-9,12-二烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名称) (781) +TX、14-甲基十八-1-烯 (IUPAC名称) (545) +TX、4-甲基壬醛-5-醇与4-甲基壬醛-5-酮 (IUPAC名称) (544) +TX、 α -多纹素 (multistriatin) (别名) [CCN]+TX、西部松小蠹集合信息素 (brevicomine) (别名) [CCN]+TX、十二碳二烯醇 (codlelure) (别名) [CCN]+TX、十二碳二烯醇 (codlemone) (别名) (167) +TX、诱蝇酮 (cuelure) (别名) (179) +TX、

环氧十九烷(disparlure) (277)+TX、十二碳-8-烯-1基乙酸酯(IUPAC名称) (286)+TX、十二碳-9-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (287)+TX、十二碳-8+TX、10-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (284)+TX、多米尼加(dominicalure) (别名) [CCN]+TX、4-甲基辛酸乙酯(IUPAC名称) (317)+TX、丁香酚(别名) [CCN]+TX、南部松小蠹集合信息素(frontalin) (别名) [CCN]+TX、诱虫十六酯(gossyplure) (别名) (420)+TX、诱杀烯混剂(grandlure) (421)+TX、诱杀烯混剂I (别名) (421)+TX、诱杀烯混剂II (别名) (421)+TX、诱杀烯混剂III (别名) (421)+TX、诱杀烯混剂IV (别名) (421)+TX、醋酸十六烯酯(hexalure) [CCN]+TX、齿小蠹二烯醇(ipsdienol) (别名) [CCN]+TX、小蠹烯醇(ipsenol) (别名) [CCN]+TX、金龟子性诱剂(japonilure) (别名) (481)+TX、里尼汀(lineatin) (别名) [CCN]+TX、利特乐(litlure) (别名) [CCN]+TX、粉纹夜蛾性诱剂(looplure) (别名) [CCN]+TX、诱杀酯(medlure) [CCN]+TX、蒙托么克酸(megatomoic acid) (别名) [CCN]+TX、诱虫醚(methyl eugenol) (别名) (540)+TX、诱虫烯(muscalure) (563)+TX、十八-2,13-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (588)+TX、十八-3,13-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (589)+TX、贺康彼(orfralure) (别名) [CCN]+TX、oryctalure (别名) (317)+TX、非乐康(ostramone) (别名) [CCN]+TX、诱虫环(siglure) [CCN]+TX、索地丁(sordidin) (别名) (736)+TX、食菌甲诱醇(sulcatol) (别名) [CCN]+TX、十四-11-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (785)+TX、特诱酮(839)+TX、特诱酮A(别名) (839)+TX、特诱酮B₁(别名) (839)+TX、特诱酮B₂(别名) (839)+TX、特诱酮C(别名) (839)和创科尔(trunc-call) (别名) [CCN]+TX,

[0501] 一种昆虫驱避剂,该昆虫驱避剂选自以下物质组成的组:2-(辛基硫代)-乙醇(IUPAC名称) (591)+TX、避蚊酮(butopyronoxyl) (933)+TX、丁氧基(聚丙二醇) (936)+TX、己二酸二丁酯(IUPAC名称) (1046)+TX、邻苯二甲酸二丁酯(1047)+TX、丁二酸二丁酯(IUPAC名称) (1048)+TX、避蚊胺[CCN]+TX、驱蚊酯(dimethyl carbate) [CCN]+TX、乙基己二醇(1137)+TX、己脲[CCN]+TX、甲喹丁(methoquin-butyl) (1276)+TX、甲基新癸酰胺[CCN]+TX、氨羰基甲酸酯(oxamate) [CCN]和羟哌酯[CCN]+TX,

[0502] 一种杀昆虫剂,该杀昆虫剂选自以下物质组成的组:1-二氯-1-硝基乙烷(IUPAC/化学文摘名称) (1058)+TX、1,1-二氯-2,2-双(4-乙基苯基)乙烷(IUPAC名称) (1056)+TX、1,2-二氯丙烷(IUPAC/化学文摘名称) (1062)+TX、具有1,3-二氯丙烯的1,2-二氯丙烷(IUPAC名称) (1063)+TX、1-溴-2-氯乙烷(IUPAC/化学文摘名称) (916)+TX、2,2,2-三氯-1-(3,4-二氯苯基)乙酸乙酯(IUPAC名) (1451)+TX、2,2-二氯乙烯基2-乙基亚磺酰基乙基甲基磷酸酯(IUPAC名) (1066)+TX、2-(1,3-1,3-二硫戊烷-2-基)苯基二甲基氨基甲酸酯(IUPAC/化学文摘名称) (1109)+TX、2-(2-叔氧基乙氧基)乙基硫氰酸酯(IUPAC/化学文摘名称) (935)+TX、2-(4,5-二甲基-1,3-二氧戊环-2-基)苯基甲基氨基甲酸酯(IUPAC/化学文摘名称) (1084)+TX、2-(4-氯-3,5-二甲基苯氧基)乙醇(IUPAC名) (986)+TX、2-氯乙烯基二乙基磷酸酯(IUPAC名) (984)+TX、2-咪唑烷酮(IUPAC名) (1225)+TX、2-isovalerylindan-1,3-二酮(IUPAC名) (1246)+TX、2-甲基(丙-2-炔基)氨基苯基甲基氨基甲酸酯(IUPAC名) (1284)+TX、2-硫氰酸醇乙基月桂酸酯(IUPAC名) (1433)+TX、3-溴-1-氯丙-1-烯(IUPAC名) (917)+TX、3-甲基-1-苯基吡唑-5-基二甲基氨基甲酸酯(IUPAC名) (1283)+TX、4-甲基(丙-2-炔基)氨基-3,5-二甲苯基甲基氨基甲酸酯(IUPAC名) (1285)+TX、5,5-二甲基-3-氧代环己-1-烯基二甲基氨基甲酸酯(IUPAC名) (1085)+TX、阿维菌素(1)

+TX、乙酰甲胺磷(2)+TX、啉虫脒(4)+TX、家蝇磷杀虫剂(别名)[CCN]+TX、乙酰虫腈[CCN]+TX、氟丙菊酯(9)+TX、丙烯腈(IUPAC名)(861)+TX、棉铃威(15)+TX、涕灭威(16)+TX、涕灭威(863)+TX、艾氏剂(864)+TX、烯丙菊酯(17)+TX、阿洛氮菌素(别名)[CCN]+TX、除害威(866)+TX、 α -氯氰菊酯(202)+TX、 α -蛻皮激素(别名)[CCN]+TX、磷化铝(640)+TX、赛果(870)+TX、果满磷(872)+TX、灭害威(873)+TX、胺吸磷杀螨剂(875)+TX、草酸氢胺吸磷(amiton hydrogen oxalate)(875)+TX、双甲脒(24)+TX、新烟碱(877)+TX、乙基杀扑磷(883)+TX、AVI 382(化合物代码)+TX、AZ 60541(化合物代码)+TX、印楝素(别名)(41)+TX、甲基吡啶磷(42)+TX、乙基谷硫磷(44)+TX、甲基谷硫磷(45)+TX、偶氮磷(889)+TX、苏云金芽孢杆菌 δ 内毒素(别名)(52)+TX、六氟硅酸钡(别名)[CCN]+TX、多硫化钡(IUPAC/化学文摘名称)(892)+TX、熏菊酯[CCN]+TX、拜耳22/190(研究代码)(893)+TX、拜耳22408(研究代码)(894)+TX、恶虫威(58)+TX、丙硫克百威(60)+TX、杀虫磺(66)+TX、 β -氟氯氰菊酯(194)+TX、 β -氯氰菊酯(203)+TX、联苯菊酯(76)+TX、生物丙烯菊酯(78)+TX、生物丙烯菊酯S-环戊烯基异构体(别名)(79)+TX、戊环苄呋菊酯[CCN]+TX、生物氯菊酯(908)+TX、苄呋菊酯(80)+TX、双(2-氯乙基)醚(IUPAC名)(909)+TX、双三氟虫脒(83)+TX、硼砂(86)+TX、溴灭菊酯(别名)+TX、溴苯烯磷(914)+TX、溴烯杀(918)+TX、溴-DDT(别名)[CCN]+TX、溴硫磷(920)+TX、溴硫磷-乙基(921)+TX、合杀威(924)+TX、稻虱净(99)+TX、畜虫威(926)+TX、特啉硫磷(927)+TX、丁酮威(103)+TX、丁酯磷(932)+TX、丁酮砒威(104)+TX、丁基吡啶灵(别名)+TX、硫线磷(109)+TX、磷酸钙[CCN]+TX、氰化钙(444)+TX、多硫化钙(IUPAC名称)(111)+TX、毒杀芬(941)+TX、氯灭杀威(943)+TX、西维因(115)+TX、卡巴呋喃(118)+TX、二硫化碳(IUPAC/化学文摘名称)(945)+TX、四氯化碳(IUPAC名)(946)+TX、三硫磷(947)+TX、丁硫克百威(119)+TX、杀螟丹(123)+TX、盐酸杀螟丹(123)+TX、瑟瓦定(别名)(725)+TX、冰片丹(960)+TX、氯丹(128)+TX、十氯酮(963)+TX、杀虫脒(964)+TX、盐酸杀虫脒(964)+TX、氯氧磷(129)+TX、溴虫腈(130)+TX、毒虫畏(131)+TX、氟啉脒(132)+TX、氯甲磷(136)+TX、氯仿[CCN]+TX、氯化苦(141)+TX、氯腈肟磷(989)+TX、氯吡啶磷(990)+TX、毒死蜱(145)+TX、毒死蜱-甲基(146)+TX、虫螨磷(994)+TX、环虫酰肼(150)+TX、瓜菊酯I(696)+TX、瓜菊酯II(696)+TX、瓜菊酯(696)+TX、顺式-苄呋菊酯(别名)+TX、顺式苄呋菊酯(80)+TX、三氟氯氰菊酯(别名)+TX、地虫威(999)+TX、氯氰碘柳胺(别名)[CCN]+TX、噻虫胺(165)+TX、乙酰亚砷酸铜[CCN]+TX、砷酸铜[CCN]+TX、油酸铜[CCN]+TX、蝇毒磷(174)+TX、畜虫磷(1006)+TX、克罗米通(别名)[CCN]+TX、巴毒磷(1010)+TX、育畜磷(1011)+TX、冰晶石(别名)(177)+TX、CS 708(研究代码)(1012)+TX、苯腈磷(1019)+TX、杀螟腈(184)+TX、果虫磷(1020)+TX、环虫菊酯[CCN]+TX、乙氰菊酯(188)+TX、氟氯氰菊酯(193)+TX、三氟氯氰菊酯(196)+TX、氯氰菊酯(201)+TX、苯氰菊酯(206)+TX、灭蝇胺(209)+TX、畜蟀磷(别名)[CCN]+TX、d-柠檬烯(别名)[CCN]+TX、d-胺菊酯(别名)(788)+TX、DAEP(1031)+TX、棉隆(216)+TX、DDT(219)+TX、一甲呋喃丹(1034)+TX、溴氰菊酯(223)+TX、田乐磷(1037)+TX、田乐磷-0(1037)+TX、田乐磷-S(1037)+TX、内吸磷(1038)+TX、内吸磷-甲基(224)+TX、内吸磷-0(1038)+TX、内吸磷-0-甲基(224)+TX、内吸磷-S(1038)+TX、内吸磷-S-甲基(224)+TX、横吸怜(demeton-S- methylsulphon)(1039)+TX、丁醚脒(226)+TX、氯亚胺硫磷(1042)+TX、二胺磷(1044)+TX、二嗪农(227)+TX、异氯硫磷(1050)+TX、除线磷(1051)+TX、敌敌畏(236)+TX、二克磷(别名)+TX、敌来死(别名)[CCN]+TX、百治磷(243)+TX、地昔尼尔(244)+TX、狄氏剂(1070)+TX、5-甲基吡啶-3-基

磷酸二乙基酯 (IUPAC 名) (1076)+TX、除虫脲 (250)+TX、双羟丙茶碱 (别名) [CCN]+TX、四氟甲醚菊酯 [CCN] +TX、甲氟磷 (1081)+TX、地麦威 (1085)+TX、乐果 (262)+TX、苜蓿酯 (1083)+TX、甲基毒虫畏 (265)+TX、敌蝇威 (1086)+TX、消螨酚 (1089)+TX、消螨酚 (dinex-diclexine) (1089)+TX、丙硝酚 (1093) +TX、戊硝酚 (1094)+TX、地乐酚 (1095)+TX、呋虫胺 (271)+TX、苯虫醚 (1099)+TX、蔬果磷 (1100)+TX、二氧威 (1101)+TX、敌杀磷 (1102)+TX、乙拌磷 (278)+TX、噻喃磷 (1108)+TX、DNOC (282) +TX、多拉菌素 (别名) [CCN]+TX、DSP (1115)+TX、脱皮甾酮 (别名) [CCN]+TX、EI 1642 (研究代码) (1118)+TX、甲氨基阿维菌素 (291)+TX、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐 (291)+TX、EMPC (1120) + TX、烯炔菊酯 (292)+TX、硫丹 (294)+TX、因毒磷 (1121)+TX、安特灵 (1122)+TX、EPBP (1123)+TX、EPN (297)+TX、保幼醚 (1124) + TX、依立诺克丁 (别名) [CCN]+TX、高氰戊菊酯 (302)+TX、依他伏杀 (别名) [CCN]+TX、杀虫丹 (308)+TX、乙硫磷 (309)+TX、乙虫清 (310)+TX、益果-甲基 (1134)+TX、灭线磷 (312)+TX、甲酸乙酯 (IUPAC 名) [CCN]+TX、乙基-DDD (别名) (1056)+TX、二溴化乙烯 (316)+TX、二氯化乙烯 (化学名称) (1136)、环氧乙烷 [CCN]、醚菊酯 (319)+TX、乙啶硫磷 (1142)+TX、EXD (1143)+TX、氨磺磷 (323) +TX、克线磷 (326)+TX、抗螨唑 (1147)+TX、皮蝇硫磷 (1148) + TX、乙苯威 (1149)+TX、五氟苯菊酯 (1150)+TX、杀螟硫磷 (335) + TX、仲丁威 (336)+TX、非诺克林 (1153)+TX、苯氧威 (340)+TX、吡氯氰菊酯 (1155)+TX、甲氰菊酯 (342)+TX、吡螨胺 (别名)+TX、丰索磷 (1158)+TX、倍硫磷 (346)+TX、倍硫磷-乙基 [CCN]+TX、氰戊菊酯 (349)+TX、氟虫腈 (354)+TX、氟尼胺 (358)+TX、氟虫双酰胺 (CAS 登记号:272451-65-7)+TX、伏康脲 (1168)+TX、氟环脲 (366) +TX、氟氰戊菊酯 (367)+TX、联氟螨 (1169)+TX、啞虫胺 [CCN]+TX、氟芬隆 (370)+TX、三氟醚 (1171)+TX、氟氯苯菊酯 (372)+TX、氟胺氰菊酯 (1184)+TX、FMC 1137 (研究代码) (1185)+TX、地虫磷 (1191)+TX、杀螨脲 (405)+TX、盐酸杀螨脲 (405)+TX、安果 (1192)+TX、胺甲威 (1193)+TX、丁苯硫磷 (1194)+TX、福司吡酯 (1195)+TX、噻唑磷 (408)+TX、丁硫环磷 (1196) +TX、呋线威 (412)+TX、抗虫菊 (1200)+TX、 γ -三氟氯氰菊酯 (197)+TX、 γ -HCH (430)+TX、双胍盐 (422)+TX、乙酸双胍盐 (422)+TX、GY-81 (研究代码) (423)+TX、苜蓿醚 (424)+TX、氯虫酰胺 (425)+TX、HCH (430)+TX、HEOD (1070)+TX、七氯 (1211)+TX、庚烯磷 (432) + TX、速杀硫磷 [CCN]、氟铃脲 (439)+TX、HHDN (864)+TX、氟蚁腓 (443)+TX、氰化氢 (444)+TX、烯虫乙酯 (445)+TX、奋淋威 (1223)+TX、吡虫啉 (458)+TX、炔咪菊酯 (460)+TX、茚虫威 (465)+TX、碘甲烷 (IUPAC 名) (542)+TX、IPSP (1229)+TX、苯线磷 (1231)+TX、碳氯灵 (1232)+TX、水胺硫磷 (别名) (473)+TX、异艾氏剂 (1235)+TX、异柳磷 (1236)+TX、移栽灵 (1237)+TX、叶蝉散 (472) +TX、O-(甲氧基氨基硫代磷酰基) 水杨酸异丙基酯 (IUPAC 名) (473)+TX、稻瘟灵 (474)+TX、异拌磷 (1244)+TX、异恶唑磷 (480)+TX、伊佛霉素 (别名) [CCN]+TX、茉莉菊酯 I (696)+TX、茉莉菊酯 II (696)+TX、碘硫磷 (1248)+TX、保幼激素 I (别名) [CCN]+ TX、保幼激素 II (别名) [CCN] +TX、保幼激素 III (别名) [CCN]+TX、氯戊环 (1249)+TX、烯虫炔酯 (484)+TX、 λ -三氟氯氰菊酯 (198)+TX、砷酸铅 [CCN]+TX、雷皮菌素 (CCN)+TX、溴苯磷 (1250)+TX、林丹 (430)+TX、啉虫磷 (1251)+TX、氯芬奴隆 (490)+TX、噻唑磷 (1253)+TX、甲基氨基甲酸间异丙苯基酯 (IUPAC 名) (1014)+TX、磷化镁 (IUPAC 名) (640)+TX、马拉硫磷 (492)+TX、丙螨氰 (1254) + TX、叠氮磷 (1255)+TX、灭蚜磷 (502)+TX、甲基灭蚜磷 (1258) + TX、灭蚜松 (1260)+TX、地安磷 (1261) +TX、氯化亚汞 (513)+TX、甲亚砷磷 (1263)+TX、氰氟虫腓 (CCN)+TX、威百亩 (519)+TX、威百亩-钾 (别名) (519)+TX、威百亩-钠 (519)+TX、虫螨畏 (1266)+TX、甲胺磷 (527)+TX、氟化甲磺酰

基 (IUPAC/化学文摘名称) (1268) + TX、杀扑磷 (529) + TX、灭虫威 (530) + TX、杀虫乙烯磷 (1273) + TX、灭多虫 (531) + TX、烯虫酯 (532) + TX、奎纳克林-丁基 (1276) + TX、甲醚菊酯 (别名) (533) + TX、甲氧滴滴涕 (534) + TX、甲氧虫酰肼 (535) + TX、甲基溴 (537) + TX、异硫氰酸甲酯 (543) + TX、甲基氯仿 (别名) [CCN] + TX、氯化甲烷 [CCN] + TX、甲氧苄氟菊酯 [CCN] + TX、速灭威 (550) + TX、恶虫酮 (1288) + TX、速灭磷 (556) + TX、兹克威 (1290) + TX、密灭汀 (557) + TX、米尔贝肟 (别名) [CCN] + TX、丙胺氟 (1293) + TX、灭蚁灵 (1294) + TX、久效磷 (561) + TX、茂果 (1300) + TX、莫昔克丁 (别名) [CCN] + TX、萘肽磷 (别名) [CCN] + TX、二溴磷 (567) + TX、萘 (IUPAC/化学文摘名称) (1303) + TX、NC-170 (研究代码) (1306) + TX、NC-184 (化合物代码) + TX、烟碱 (578) + TX、硫酸烟碱 (578) + TX、氟蚁灵 (1309) + TX、烯啶虫胺 (579) + TX、硝乙脲噻唑 (1311) + TX、戊氰威 (1313) + TX、戊氰威1:1氯化锌络合物 (1313) + TX、NNI-0101 (化合物代码) + TX、NNI-0250 (化合物代码) + TX、降烟碱 (传统名称) (1319) + TX、双苯氟脲 (585) + TX、多氟脲 (586) + TX、乙基硫代磷酸0,2,5-二氯-4-碘苯基0-乙基酯 (IUPAC名) (1057) + TX、硫代磷酸0,0-二乙基0-4-甲基-2-氧代-2H-色烯-7-基酯 (IUPAC名) (1074) + TX、硫代磷酸0,0-二乙基0-6-甲基-2-丙基嘧啶-4-基酯 (IUPAC名) (1075) + TX、二硫代焦磷酸0,0,0',0'-四丙基酯 (IUPAC名) (1424) + TX、油酸 (IUPAC名) (593) + TX、氧乐果 (594) + TX、草氨酰 (602) + TX、亚砷磷 (oxydemeton-methyl) (609) + TX、异亚砷磷 (1324) + TX、砷拌磷 (1325) + TX、pp'-DDT (219) + TX、对二氯苯 [CCN] + TX、对硫磷 (615) + TX、对硫磷-甲基 (616) + TX、氟幼脲 (别名) [CCN] + TX、五氯苯酚 (623) + TX、月桂酸五氯苯基酯 (IUPAC名) (623) + TX、苄氯菊酯 (626) + TX、石油 (别名) (628) + TX、PH 60-38 (研究代码) (1328) + TX、芬硫磷 (1330) + TX、苯醚菊酯 (630) + TX、稻丰散 (631) + TX、甲拌磷 (636) + TX、伏杀磷 (637) + TX、硫环磷 (1338) + TX、亚胺硫磷 (638) + TX、对氯硫磷 (1339) + TX、磷胺 (639) + TX、膦 (IUPAC名称) (640) + TX、辛硫磷 (642) + TX、辛硫磷-甲基 (1340) + TX、甲胺啶磷 (1344) + TX、抗蚜威 (651) + TX、嘧啶磷-乙基 (1345) + TX、嘧啶磷-甲基 (652) + TX、聚氯二环戊二烯异构体 (IUPAC名) (1346) + TX、聚氯萘烯 (传统名称) (1347) + TX、亚砷酸钾 [CCN] + TX、硫氰酸钾 [CCN] + TX、炔丙菊酯 (655) + TX、早熟素I (别名) [CCN] + TX、早熟素II (别名) [CCN] + TX、早熟素III (别名) [CCN] + TX、乙酰嘧啶磷 (1349) + TX、丙溴磷 (662) + TX、丙氟菊酯 [CCN] + TX、蜚虱威 (1354) + TX、猛杀威 (1355) + TX、丙虫磷 (1356) + TX、巴胺磷 (673) + TX、残杀威 (678) + TX、乙噻唑磷 (1360) + TX、丙硫磷 (686) + TX、发硫磷 (1362) + TX、丙苯炔菊酯 [CCN] + TX、吡蚜酮 (688) + TX、吡唑硫磷 (689) + TX、定菌磷 (693) + TX、反灭虫菊 (1367) + TX、除虫菊酯I (696) + TX、除虫菊酯II (696) + TX、除虫菊酯 (696) + TX、哒螨灵 (699) + TX、啉虫丙醚 (700) + TX、哒嗪硫磷 (701) + TX、嘧螨醚 (706) + TX、嘧硫磷 (1370) + TX、吡丙醚 (708) + TX、苦木 (别名) [CCN] + TX、喹恶磷 (711) + TX、喹恶磷-甲基 (1376) + TX、畜宁磷 (1380) + TX、喹硫磷 (1381) + TX、R-1492 (研究代码) (1382) + TX、碘醚柳胺 (别名) [CCN] + TX、苄呋菊酯 (719) + TX、鱼藤酮 (722) + TX、RU 15525 (研究代码) (723) + TX、RU 25475 (研究代码) (1386) + TX、鱼尼丁 (别名) (1387) + TX、利阿诺定 (传统名称) (1387) + TX、沙巴藜芦 (别名) (725) + TX、八甲磷 (1389) + TX、克线丹 (别名) + TX、司拉克丁 (别名) [CCN] + TX、SI-0009 (化合物代码) + TX、SI-0205 (化合物代码) + TX、SI-0404 (化合物代码) + TX、SI-0405 (化合物代码) + TX、氟硅菊酯 (728) + TX、SN 72129 (研究代码) (1397) + TX、亚砷酸钠 [CCN] + TX、氰化钠 (444) + TX、氟化钠 (IUPAC/化学文摘名称) (1399) + TX、六氟硅酸钠 (1400) + TX、五氯酚钠 (623) + TX、硒酸钠 (IUPAC名称) (1401) + TX、硫氰酸钠 [CCN] + TX、苏硫磷 (1402) + TX、

多杀菌素(737)+TX、螺甲螨酯(739)+TX、螺虫乙酯(CCN)+TX、磺苯醚隆(746)+TX、磺苯醚隆-钠(746)+TX、氟虫胺(750)+TX、治螟磷(753)+TX、氟化硫酰基(756)+TX、硫丙磷(1408)+TX、焦油(别名)(758)+TX、氟胺氰菊酯(tau- fluvalinate)(398)+TX、噻螨威(1412)+TX、TDE(1414)+TX、虫酰肼(762)+TX、吡螨胺(763)+TX、丁基嘧啶磷(764)+TX、氟苯脲(768)+TX、七氟菊酯(769)+TX、双硫磷(770)+TX、TEPP(1417)+TX、环戊烯丙菊酯(1418)+TX、叔丁威(别名)+TX、特丁磷(773)+TX、四氯乙烷[CCN]+TX、杀虫畏(777)+TX、胺菊酯(787)+TX、 θ -氯氰菊酯(204)+TX、噻虫啉(791)+TX、噻芬诺(别名)+TX、噻虫嗪(792)+TX、苯噻硫磷(1428)+TX、抗虫威(1431)+TX、杀虫环(798)+TX、草酸氢杀虫环(798)+TX、硫敌克(799)+TX、久效威(800)+TX、甲基乙拌磷(801)+TX、硫磷嗪(1434)+TX、杀虫双(803)+TX、杀虫双(thiosultap-sodium)(803)+TX、苏云金素(别名)[CCN]+TX、啉虫酰胺(809)+TX、四溴菊酯(812)+TX、四氟苯菊酯(813)+TX、反氯菊酯(1440)+TX、威菌磷(1441)+TX、啉蚜威(818)+TX、三唑磷(820)+TX、啉呀威(别名)+TX、三氯磷酸酯(824)+TX、异皮蝇磷-3(别名)[CCN]+TX、毒壤膦(1452)+TX、三氯丙氧磷(1455)+TX、杀虫隆(835)+TX、混杀威(840)+TX、烯虫硫酯(1459)+TX、蚜灭多(847)+TX、氟吡啉虫[CCN]+TX、藜芦定(别名)(725)+TX、藜芦碱(别名)(725)+TX、XMC(853)+TX、灭杀威(854)+TX、YI-5302(化合物代码)+TX、 ζ -氯氰菊酯(205)+TX、zetamethrin(别名)+TX、磷化锌(640)+TX、丙硫噁唑磷(zolaprofos)(1469)和ZXI 8901(研究代码)(858)+TX、氰虫酰胺[736994-63-19]+TX、氯虫苯甲酰胺[500008-45-7]+TX、腈吡螨酯[560121-52-0]+TX、丁氟螨酯[400882-07-7]+TX、新啉啉啉[337458-27-2]+TX、乙基多杀菌素[187166-40-1+187166-15-0]+TX、螺虫乙酯[203313-25-1]+TX、砒虫啉[946578-00-3]+TX、丁烯氟虫腈[704886-18-0]+TX、氯氟醚菊酯[915288-13-0]+TX、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)[84937-88-2]+TX、四氟啉菊酯(triflumezopyrim)+TX(在WO 2012/092115中所披露的),

[0503] 一种杀软体动物剂,该杀软体动物剂选自由以下物质组成的组:二(三丁基锡)氧化物(IUPAC名称)(913)+TX、溴乙酰胺[CCN]+TX、砷酸钙[CCN]+TX、除线威(cloethocarb)(999)+TX、乙酰亚砷酸铜[CCN]+TX、硫酸铜(172)+TX、三苯锡(347)+TX、磷酸铁(IUPAC名称)(352)+TX、四聚乙醛(518)+TX、灭虫威(530)+TX、氯硝柳胺(576)+TX、氯硝柳胺乙醇胺盐(576)+TX、五氯酚(623)+TX、五氯苯氧化钠(623)+TX、噻螨威(tazimcarb)(1412)+TX、硫双威(799)+TX、三丁基氧化锡(913)+TX、杀螺吗啉(trifenmorph)(1454)+TX、混杀威(trimethacarb)(840)+TX、乙酸三苯基锡(IUPAC名称)(347)和三苯基氢氧化锡(IUPAC名称)(347)+TX、皮瑞普(pyriprole)[394730-71-3]+TX,

[0504] 一种杀线虫剂,该杀线虫剂选自由以下物质组成的组:AKD-3088(化合物代码)+TX、1,2-二溴-3-氯丙烷(IUPAC/化学文摘名)(1045)+TX、1,2-二氯丙烷(IUPAC/化学文摘名)(1062)+TX、1,2-二氯丙烷与1,3-二氯丙烯(IUPAC名称)(1063)+TX、1,3-二氯丙烯(233)+TX、3,4-二氯四氢噻吩1,1-二氧化物(IUPAC/化学文摘名)(1065)+TX、3-(4-氯苯基)-5-甲基绕丹宁(IUPAC名称)(980)+TX、5-甲基-6-硫代-1,3,5-噻二嗪烷-3-基乙酸(IUPAC名称)(1286)+TX、6-异戊烯基氨基嘌呤(别名)(210)+TX、阿巴美丁(1)+TX、乙酰虫腈[CCN]+TX、棉铃威(15)+TX、涕灭威(aldicarb)(16)+TX、涕灭砒威(aldoxycarb)(863)+TX、AZ 60541(化合物代码)+TX、benclothiaz[CCN]+TX、苯菌灵(62)+TX、丁基吡啶酮(butylpyridaben)(别名)+TX、硫线磷(cadusafos)(109)+TX、克百威(carbofuran)(118)+TX、二硫化碳(945)+

TX、丁硫克百威 (119)+TX、氯化苦 (141)+TX、毒死蜱 (145)+TX、除线威 (cloethocarb) (999)+TX、细胞分裂素 (cytokinins) (别名) (210)+ TX, 棉隆 (216)+TX、DBCP (1045)+TX、DCIP (218)+TX、除线特 (diamidafos) (1044)+TX、除线磷 (dichlofenthion) (1051)+TX、二克磷 (dicliphos) (别名)+TX、乐果 (262)+TX、依马克丁 (别名) [CCN] +TX、苯甲酸依马克丁 (291)+TX、依立诺克丁 (291)+TX、(别名) [CCN]+TX、灭线磷 (312)+TX、二溴乙烷 (316)+TX、苯线磷 (fenamiphos) (326)+TX、吡螨胺 (别名)+TX、丰索磷 (fenpyrad) (1158)+TX、噻唑磷 (fosthiazate) (408)+TX、丁硫环磷 (fosthietan) (1196)+TX、糠醛 (别名) [CCN]+TX、GY-81 (研究代码) (423)+ TX、速杀硫磷 (heterophos) [CCN]+TX、碘甲烷 (IUPAC名称) (542)+ TX、isamidofos (1230)+TX、氯唑磷 (isazofos) (1231)+TX、激动素 (kinetin) (别名) [CCN]+TX、糠氨基嘌呤 (mecarphon) (别名) (210)+TX、甲基灭蚜磷 (mecarphon) (1258)+TX、威百亩 (519)+ TX、威百亩钾盐 (别名) (519)+TX、威百亩钠盐 (519)+TX、甲基溴 (537)+TX、异硫氰酸甲酯 (543)+TX、杀螨菌素肟 (milbemycin oxime) (别名) [CCN]+TX、莫昔克丁 (别名) [CCN]+TX、疣孢漆斑菌 (*Myrothecium verrucaria*) 组分 (别名) (565)+TX、NC-184 (化合物代码)+TX、杀线威 (602)+TX、甲拌磷 (636)+TX、磷胺 (639)+TX、磷虫威 (phosphocarb) [CCN]+TX、硫线磷 (sebufos) (别名)+TX、塞拉菌素 (selamectin) (别名) [CCN]+TX、多杀菌素 (737)+TX、叔丁威 (terbam) (别名)+TX、特丁磷 (terbufos) (773)+TX、四氯噻吩 (IUPAC/化学文摘名) (1422)+TX、thiaf enox (别名)+TX、虫线磷 (thionazin) (1434)+TX、三唑磷 (triazophos) (820)+TX、triazuron (别名)+TX、二甲苯酚 [CCN]+TX、YI-5302 (化合物代码) 和玉米素 (别名) (210)+TX、fluensulfone [318290-98-1]+TX,

[0505] 一种硝化作用抑制剂,该硝化作用抑制剂选自由以下物质组成的组:乙基黄原酸钾 [CCN]以及氯啶 (nitrapyrin) (580)+TX,

[0506] 一种植物激活剂,该植物激活剂选自由以下物质组成的组:噻二唑素 (acibenzolar) (6)+TX、噻二唑素-S-甲基 (6)+TX、烯丙苯噻唑 (probenazole) (658) 和大虎杖 (*Reynoutria sachalinensis*) 提取物 (别名) (720)+TX,

[0507] 一种杀鼠剂,该杀鼠剂选自由以下物质组成的组:2-异戊酰茛满-1,3-二酮 (IUPAC名称) (1246)+TX、4-(啞啉啉-2-基氨基) 苯磺酰胺 (IUPAC名称) (748)+TX、 α -氯代醇 [CCN]+TX、磷化铝 (640)+TX、安妥 (880)+TX、三氧化二砷 (882)+TX、碳酸钡 (891)+TX、双鼠脲 (912)+TX、溴鼠隆 (89)+TX、溴敌隆 (91)+TX、溴鼠胺 (92)+TX、氰化钙 (444)+TX、氮醛糖 (127)+TX、氯鼠酮 (140)+TX、维生素D3 (别名) (850)+TX、氯灭鼠灵 (1004)+TX、克灭鼠 (1005)+TX、杀鼠萘 (175)+TX、杀鼠啉啶 (1009)+TX、鼠得克 (246)+TX、噻鼠灵 (249)+TX、敌鼠钠 (273)+TX、维生素D2 (301)+TX、氟鼠灵 (357)+TX、氟乙酰胺 (379)+TX、鼠朴定 (1183)+TX、盐酸鼠朴定 (1183)+TX、 γ -HCH (430)+TX、HCH (430)+TX、氢氰酸 (444)+TX、碘甲烷 (IUPAC名称) (542)+TX、林旦 (430)+TX、磷化镁 (IUPAC名称) (640)+TX、甲基溴 (537)+TX、鼠特灵 (1318)+TX、毒鼠磷 (1336)+TX、磷化氢 (IUPAC名称) (640)+TX、磷 [CCN]+TX、杀鼠酮 (1341)+TX、亚砷酸钾 [CCN]+TX、灭鼠优 (1371)+TX、海葱糖苷 (1390)+TX、亚砷酸钠 [CCN]+TX、氰化钠 (444)+TX、氟乙酸钠 (735)+TX、士的宁 (745)+TX、硫酸铊 [CCN]+TX、杀鼠灵 (851) 以及磷化锌 (640)+TX,

[0508] 一种增效剂,该增效剂选自由以下物质组成的组:2-(2-丁氧基乙氧基) 乙基胡椒基酯 (IUPAC名称) (934)+TX、5-(1,3-苯并二氧杂环戊烯-5-基)-3-己基环己-2-烯酮

(IUPAC名称) (903)+TX、具有橙花叔醇的法呢醇(别名) (324)+TX、MB-599(研究代码) (498)+TX、MGK 264(研究代码) (296)+TX、增效醚(piperonyl butoxide) (649)+TX、增效醛(piprotal) (1343)+TX、增效酯(propyl isomer) (1358)+TX、S421(研究代码) (724)+TX、增效散(sesamex) (1393)+TX、芝麻林素(sesamol) (1394)和亚砷(1406)+TX,

[0509] 一种动物驱避剂,该动物驱避剂选自由以下物质组成的组:葱醌(32)+TX、氯醛糖(127)+TX、环烷酸铜[CCN]+TX、王铜(171)+TX、二嗪磷(227)+TX、二环戊二烯(化学名称) (1069)+TX、双胍盐(guazatine) (422)+TX、双胍醋酸盐(422)+TX、灭虫威(530)+TX、吡啶-4-胺(IUPAC名称) (23)+TX、塞仑(804)+TX、混杀威(trimethacarb) (840)+TX、环烷酸锌[CCN]和福美锌(856)+TX,

[0510] 一种杀病毒剂,该杀病毒剂选自由以下物质组成的组:衣马宁(别名)[CCN]和利巴韦林(别名)[CCN]+TX,

[0511] 一种创伤保护剂,该创伤保护剂选自由以下物质组成的组:氧化汞(512)+TX、辛噻酮(590)和甲基硫菌灵(802)+TX,

[0512] 以及生物活性化合物,这些化合物选自由以下物质组成的组:阿扎康唑[60207-31-0]+TX、联苯三唑醇[70585-36-3]+TX、糠菌唑[116255-48-2]+TX、环唑醇[94361-06-5]+TX、苯醚甲环唑[119446-68-3]+TX、烯唑醇[83657-24-3]+TX、氟环唑[106325-08-0]+TX、腈苯唑[114369-43-6]+TX、氟唑唑[136426-54-5]+TX、氟硅唑[85509-19-9]+TX、粉唑醇[76674-21-0]+TX、己唑醇[79983-71-4]+TX、抑霉唑[35554-44-0]+TX、亚胺唑[86598-92-7]+TX、种菌唑[125225-28-7]+TX、叶菌唑[125116-23-6]+TX、腈菌唑[88671-89-0]+TX、稻瘟酯[101903-30-4]+TX、戊菌唑[66246-88-6]+TX、丙硫菌唑[178928-70-6]+TX、啉斑肟(pyriphenox) [88283-41-4]+TX、丙氯灵[67747-09-5]+TX、丙环唑[60207-90-1]+TX、硅氟唑(simeconazole) [149508-90-7]+TX、戊唑醇[107534-96-3]+TX、氟醚唑[112281-77-3]+TX、三唑酮[43121-43-3]+TX、三唑酮[55219-65-3]+TX、氟菌唑[99387-89-0]+TX、灭菌唑[131983-72-7]+TX、三环苯嘧啶醇[12771-68-5]+TX、氯苯嘧啶醇[60168-88-9]+TX、氟氯苯嘧啶醇[63284-71-9]+TX、乙嘧啶磺酸酯(bupirimate) [41483-43-6]+TX、甲菌定(dimethirimol) [5221-53-4]+TX、乙菌定(ethirimol) [23947-60-6]+TX、十二环吗啉[1593-77-7]+TX、苯锈啶(fenpropidine) [67306-00-7]+TX、丁苯吗啉[67564-91-4]+TX、螺环菌胺[118134-30-8]+TX、十三吗啉[81412-43-3]+TX、嘧菌环胺[121552-61-2]+TX、嘧菌胺[110235-47-7]+TX、嘧霉胺(pyrimethanil) [53112-28-0]+TX、拌种咯[74738-17-3]+TX、咯菌腈(fludioxonil) [131341-86-1]+TX、苯霜灵(benalaxyl) [71626-11-4]+TX、呋霜灵(furalaxyl) [57646-30-7]+TX、甲霜灵[57837-19-1]+TX、R甲霜灵[70630-17-0]+TX、呋酰胺[58810-48-3]+TX、恶霜灵(Oxadixyl) [77732-09-3]+TX、苯菌灵[17804-35-2]+TX、多菌灵[10605-21-7]+TX、咪菌威(debacarb) [62732-91-6]+TX、麦穗宁[3878-19-1]+TX、噻苯达唑[148-79-8]+TX、乙菌利(chlozoline) [84332-86-5]+TX、菌核利(dichlozoline) [24201-58-9]+TX、异菌脲(Iprodione) [36734-19-7]+TX、甲菌利(myclozoline) [54864-61-8]+TX、腐霉利(procymidone) [32809-16-8]+TX、乙烯菌核利(vinclozoline) [50471-44-8]+TX、啉酰菌胺(boscalid) [188425-85-6]+TX、萎锈灵[5234-68-4]+TX、甲呋酰苯胺[24691-80-3]+TX、氟酰胺(Flutolanil) [66332-96-5]+TX、灭锈胺[55814-41-0]+TX、氧化萎锈灵[5259-88-1]+TX、吡噻菌胺(penthiopyrad) [183675-

82-3]+TX、噻呋菌胺[130000-40-7]+TX、双胍盐 [108173-90-6]+TX、多果定(dodine) [2439-10-3][112-65-2] (游离碱)+ TX、双胍辛胺(iminoctadine) [13516-27-3]+TX、噻菌酯[131860-33-8]+ TX、醚菌胺[149961-52-4]+TX、烯炔菌酯{Proc.BCPC,Int.Congr., Glasgow.2003,1,93}+TX、氟嘧菌酯[361377-29-9]+TX、甲基醚菌酯 [143390-89-0]+TX、苯氧菌胺[133408-50-1]+TX、肟菌酯[141517-21-7]+ TX、肟醚菌胺[248593-16-0]+TX、啉氧菌酯[117428-22-5]+TX、唑菌胺酯 [175013-18-0]+TX、福美铁[14484-64-1]+TX、代森锰锌[8018-01-7]+TX、代森锰[12427-38-2]+TX、代森联[9006-42-2]+TX、甲代森锌(propineb) [12071-83-9]+TX、塞仑[137-26-8]+TX、代森锌[12122-67-7]+TX、福美锌 [137-30-4]+TX、敌菌丹(captafol) [2425-06-1]+TX、克菌丹[133-06-2]+ TX、苯氟磺胺[1085-98-9]+TX、唑啉草(fluoroimide) [41205-21-4]+TX、灭菌丹[133-07-3]+TX、甲苯氟磺胺[731-27-1]+TX、波尔多(bordeaux) 混合物[8011-63-0]+TX、氢氧化铜(copperhydroxid) [20427-59-2]+TX、氯化铜(copperoxychlorid) [1332-40-7]+TX、硫酸铜(coppersulfat) [7758-98-7] +TX、氧化铜(copperoxid) [1317-39-1]+TX、代森锰铜(mancopper) [53988-93-5]+TX、喹啉铜(oxine-copper) [10380-28-6]+TX、敌螨普 (dinocap) [131-72-6]+TX、酞菌酯(硝基thal-isopropyl) [10552-74-6]+ TX、克瘟散[17109-49-8]+TX、异稻瘟净(iprobenphos) [26087-47-8]+TX、稻瘟灵(isoprothiolane) [50512-35-1]+TX、氯瘟磷(phosdiphen) [36519-00-3]+TX、克菌磷(pyrazophos) [13457-18-6]+TX、甲基托氯磷(tolclofos- methyl) [57018-04-9]+TX、苯并噻二唑(acibenzolar-S-methyl) [135158-54-2] +TX、敌菌灵[101-05-3]+TX、苯噻菌胺[413615-35-7]+TX、灭瘟素 (blasticidin)-S[2079-00-7]+TX、灭螨猛(chinomethionat) [2439-01-2]+ TX、地茂散(chloroneb) [2675-77-6]+TX、百菌清[1897-45-6]+TX、环氟菌胺[180409-60-3]+TX、霜脲氰[57966-95-7]+TX、二氯萘醌(dichlone) [117- 80-6]+TX、双氯氰菌胺(diclocymet) [139920-32-4]+TX、哒菌酮 (diclomezine) [62865-36-5]+TX、氯硝胺(dicloran) [99-30-9]+TX、乙霉威(diethofencarb) [87130-20-9]+TX、烯酰吗啉[110488-70-5]+TX、SYP- LI90(Flumorph) [211867-47-9]+TX、二噻农(dithianon) [3347-22-6]+ TX、噻唑菌胺(ethaboxam) [162650-77-3]+TX、土菌灵(etridiazole) [2593-15-9]+TX、恶唑菌酮[131807-57-3]+TX、咪唑菌酮(fenamidone) [161326-34-7]+TX、稻瘟酰胺(Fenoxanil) [115852-48-7]+TX、三苯锡 (fentin) [668-34-8]+TX、噻菌腈(ferimzone) [89269-64-7]+TX、氟啉胺 (fluazinam) [79622-59-6]+TX、氟吡菌胺(fluopicolide) [239110-15-7]+ TX、磺菌胺(flusulfamide) [106917-52-6]+TX、环酰菌胺[126833-17-8]+ TX、福赛得(fosetyl-aluminium) [39148-24-8]+TX、恶霉灵(hymexazol) [10004-44-1]+TX、丙森锌[140923-17-7]+TX、IKF-916(赛座灭(Cyazofamid)) [120116-88-3]+TX、春雷霉素(kasugamycin) [6980-18-3] +TX、磺菌威(methasulfocarb) [66952-49-6]+TX、苯菌酮[220899-03-6]+ TX、戊菌隆(pencycuron) [66063-05-6]+TX、苯酞[27355-22-2]+TX、多氧霉素(polyoxins) [11113-80-7]+TX、噻菌灵(probenazole) [27605-76-1]+ TX、百维威(propamocarb) [25606-41-1]+TX、碘啉唑酮(proquinazid) [189278-12-4]+TX、乐喹酮(pyroquilon) [57369-32-1]+TX、喹氧灵[124495-18-7]+TX、五氯硝苯[82-68-8]+TX、硫[7704-34-9]+TX、噻酰菌胺 [223580-51-6]+TX、咪唑啉(triazoxide) [72459-58-6]+TX、三环唑[41814- 78-2]+TX、噻氨灵[26644-46-2]+TX、有效霉素[37248-47-8]+TX、苯酰菌胺(zoxamide) (RH7281) [156052-68-5]+TX、双炔

酰菌胺 (mandipropamid) [374726-62-2]+TX、吡蚜酮 (isopyrazam) [881685-58-1] +TX、塞德因 (sedaxane) [874967-67-6]+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酸(9-二氯亚甲基-1,2,3,4-四氢-1,4-桥亚甲基-萘-5-基)-酰胺(披露于W0 2007/048556中)+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酸(3',4',5'-三氟-联苯基-2-基)-酰胺(披露于W0 2006/087343中)+TX、[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[(环丙基羰基)氧基]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氢-6,12-二羟基-4,6a,12b-三甲基-11-氧代-9-(3-吡啶基)-2H,11H萘并[2,1-b]吡喃并[3,4-e]吡喃-4-基]甲基-环丙烷甲酸酯[915972-17-7]+TX以及1,3,5-三甲基-N-(2-甲基-1-氧丙基)-N-[3-(2-甲基丙基)-4-[2,2,2-三氟-1-甲氧基-1-(三氟甲基)乙基]苯基]-1H-吡啶-4-甲酰胺[926914-55-8]+TX、丁烯氟虫脞 (flufiprole) [704886-18-0]+TX、环溴虫酰胺 (cyclaniliprole) [1031756-98-5]+TX、氟氰虫酰胺 (tetraniliprole) [1229654-66-3]+TX、戊吡虫脞 (guadipyr) (描述于W0 2010/060231中)+TX以及环氧虫啉 (cycloxaprid) (描述于W0 2005/077934中)+TX。

[0513] 在活性成分之后的括号中的参考例如[3878-19-1]是指化学文摘登记号。以上描述的混合配对物是已知的。当活性成分包括在“杀有害生物剂手册 (The Pesticide Manual)”[杀有害生物剂手册-全球概览(The Pesticide Manual-A World Compendium);第13版;编著:C.D.S.汤姆林(C.D.S. TomLin);英国农作物保护委员会(The British Crop Protection Council)]中时,它们在上文对于特定化合物在圆括号内给定的条目编号之下描述于该手册中;例如,化合物“阿巴美丁”在条目编号(1)之下描述。当以上对特定化合物加入“[CCN]”时,所讨论的化合物包括在“杀有害生物剂通用名纲要 (Compendium of Pesticide Common Names)”中,该纲要在互联网上可得:[A.伍德(Wood);杀有害生物剂通用名纲要(Compendium of Pesticide Common Names),版权©1995-2004];例如,化合物“乙酰虫脞”在互联网地址<http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>下进行了描述。

[0514] 上述的活性成分中大部分在上文是通过所谓的“通用名”、相关的“ISO通用名”或在个别情况下使用的另一个“通用名”来提及。如果名称不是“通用名”,那么对于特定化合物在圆括号内给出了作为代替而使用的该名称的性质;在这种情况下,使用IUPAC名称、IUPAC/化学文摘名称、“化学名称”、“传统名称”、“化合物名称”、或“研究代码”,或者如果既没有使用这些名称之一,也没有使用“通用名”,那么使用的是“别名”。“CAS登记号”意指化学文摘登记号。

[0515] 选自组 1至11以及表 A1的具有化学式I的化合物与上述活性成分的活性成分混合物包括选自组 1至11以及表 A1的化合物和上述活性成分,优选地是处于从100:1至1:6000的混合比率,尤其是从50:1至1:50,更尤其是处于从20:1至1:20的比率,甚至更尤其从10:1至1:10,非常尤其是从5:1和 1:5,尤其优选的是从2:1至1:2的比率给出的,并且从4:1至2:1的比率同样是优选的,特别是处于1:1,或5:1,或5:2,或5:3,或5:4,或4:1,或4:2,或4:3,或3:1,或3:2,或2:1,或1:5,或2:5,或3:5,或4:5,或1:4,或2:4,或3:4,或1:3,或2:3,或1:2,或1:600,或 1:300,或1:150,或1:35,或2:35,或4:35,或1:75,或2:75,或4:75,或1:6000,或1:3000,或1:1500,或1:350,或2:350,或4:350,或1:750,或2:750,或4:750的比率。那些混合比率是按重量计的。

[0516] 如上描述的混合物可以被用于控制有害生物的方法中,该方法包括将含如上描述

的混合物的组合物施用于有害生物或其环境中,除了通过手术或疗法用于处理人或动物体的方法以及在人或动物体上实施的诊断方法之外。

[0517] 包含选自组 1至11以及表 A1的具有化学式I的化合物以及一种或多种如上描述的活性成分的混合物可以例如以单一的“掺水即用”的形式施用,以组合的喷雾混合物(该混合物由这些单一活性成分的单独配制品构成)(例如“桶混制剂”)施用,并且当以顺序的方式(即,一个在另一个适度短的时期之后,如几小时或几天)施用组合使用这些单一活性成分来施用。施用选自组 1至11以及表 A1的这些具有化学式I的化合物和如上所述活性成分的顺序对于实施本发明并不是至关重要的。

[0518] 根据本发明的组合物还可以包含其他固体或液体助剂,如稳定剂,例如未环氧化的或环氧化的植物油(例如环氧化的椰子油、菜籽油或大豆油),消泡剂(例如硅油),防腐剂,粘度调节剂,粘合剂和/或增粘剂,肥料或其他用于获得特定效果的活性成分,例如杀细菌剂、杀真菌剂、杀线虫剂、植物活化剂、杀软体动物剂或除草剂。

[0519] 根据本发明的组合物是以本身已知的方式,在不存在助剂的情况下,例如通过研磨、筛选和/或压缩固体活性成分;和在至少一种助剂的存在下,例如通过紧密混合活性成分与一种或多种助剂和/或将活性成分与一种或多种助剂一起研磨来制备。用于制备组合物的这些方法和用于制备这些组合物的化合物I的用途也是本发明的主题。

[0520] 组合物的施用方法、也就是说控制以上提及的类型的有害生物的方法,如喷雾、雾化、洒粉、涂刷、敷料、散射或倾倒,选择这些方式以适合当时环境的既定目标;以及这些组合物用于控制以上提及的类型的有害生物用途是本发明的其他主题。典型的浓度比是在0.1ppm与1000ppm之间,优选地在0.1ppm与500ppm之间的活性成分。每公顷的施用量总体上是每公顷1 g到2000g活性成分,尤其是10g/ha到1000g/ha,优选地10g/ha到600 g/ha。

[0521] 在作物保护领域中,优选的施用方法是施用至这些植物的叶(叶施药),可能的是选择施用的频率和比率以符合所提及的有害生物的侵染风险。可替代地,活性成分可以通过根系统(内吸作用)到达植物,这是通过用液体组合物将这些植物的场所浸透或者通过将固体形式的活性成分掺入植物的场所(例如掺入土壤,例如以颗粒的形式(土施))来实现的。在水稻作物的情况下,这样的颗粒剂可以被计量加入淹水的稻田中。

[0522] 本发明的化合物及其组合物还适合于保护植物繁殖材料(例如种子,如果实、块茎或籽粒,或者苗圃植物)对抗上述类型的有害生物。可以用化合物在种植前对繁殖材料进行处理,例如可以在播种前对种子进行处理。可替代地,化合物可以施用至种子籽粒(包衣),这是通过将籽粒浸渍入液体组合物中或通过施涂固体组合物层来实现的。当繁殖材料被种植在施用处时,还可能的是例如在条播期间将组合物施入种子犁沟。这些用于植物繁殖材料的处理方法和如此处理的植物繁殖材料是本发明另外的主题。典型的处理比率将取决于待控制的植物和有害生物/真菌,并且通常在每100kg种子1克至 200克之间,优选在每100kg种子5克至150克之间,如在每100kg种子10 克至100克之间。

[0523] 术语种子包括所有种类的种子以及植物繁殖体,包括但并不限于真正的种子、种子块、吸盘、谷粒、鳞球茎、果实、块茎、谷物、根茎、插条、切割枝条以及类似物并且在优选实施例中是指真正的种子。

[0524] 本发明还包括用具有化学式I的化合物包衣或处理的种子或含有具有化学式I的化合物的种子。术语“包衣或处理和/或含有”通常表示在施用的时候,在大多数情况下,活

性成分在种子的表面,尽管成分的更多或更少的部分可以渗透到种子材料中,这取决于施用的方法。当所述种子产品被(再)种植时,它可以吸收活性成分。在一个实施例中,本发明使得其上粘附有具有化学式(I)的化合物的植物繁殖材料可得。此外,由此可得包括用具有化学式(I)的化合物处理过的植物繁殖材料的组合物。

[0525] 种子处理包括本领域中已知的所有适合的种子处理技术,如拌种、种子包衣、种子撒粉、浸种以及种子造粒。可以通过任何已知的方法实现具有化学式(I)的化合物的种子处理施用,如在种子播种之前或播种/种植过程中喷雾或通过撒粉。

[0526] 生物学实例:

[0527] 化合物(P1-P6)显示在表A1中。

[0528] 实例B1:烟粉虱(棉粉虱):摄食/接触活性

[0529] 将棉花叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并且用从10'000ppm DMSO储备溶液中制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后,将叶圆片用成年粉虱进行侵染。孵育6天之后,针对死亡率对这些样品进行检查。

[0530] 以下化合物在200ppm施用率下得到至少80%的死亡率:P2。

[0531] 实例B2:黄瓜条叶甲(玉米根虫):摄食/接触活性

[0532] 将置于24孔微量滴定板中的琼脂层上的玉米芽通过喷雾用从10'000 ppm DMSO储备溶液中制备的水性测试溶液进行处理。在干燥之后,用L2期幼虫对各板进行侵染(6至10只/孔)。侵染4天之后,相比于未处理样品,针对死亡率和生长抑制对这些样品进行评估。

[0533] 以下化合物在200ppm施用率下得到至少80%的死亡率:P6、P3、P1和 P2。

[0534] 实例B3大豆褐椿(新热带褐臭椿):摄食/接触活性

[0535] 将24孔微量滴定板中的琼脂上的大豆叶用从10'000ppm DMSO储备溶液中制备的水性测试溶液进行喷雾。干燥之后,将叶用N-2期若虫进行侵染。侵染5天之后,相比于未处理样品,针对生长抑制对这些样品进行评估。

[0536] 以下化合物在200ppm施用率给出了两个类别(死亡率或生长抑制)中至少一个的至少80%的效果:P6。

[0537] 实例B4西花蓟马(西方花蓟马):摄食/接触活性

[0538] 将向日葵叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并且用从10'000 DMSO储备溶液中制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后,将叶圆片用混合年龄的花蓟马种群进行侵染。侵染7天之后,针对死亡率对这些样品进行评估。

[0539] 以下化合物在200ppm施用率下得到至少80%的死亡率:P2

[0540] 实例B5桃蚜(绿色桃蚜虫):摄食/接触活性

[0541] 将向日葵叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并且用从10'000ppm DMSO储备溶液中制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后,将叶圆片用混合年龄的蚜虫群体进行侵染。侵染6天之后,针对死亡率对这些样品进行评估。

[0542] 以下化合物在200ppm施用率下得到至少80%的死亡率:P6、P1和 P2。

[0543] 实例B6桃蚜(绿色桃蚜虫):系统活性

[0544] 将受到混合年龄的蚜虫群体侵染的豌豆幼苗的根部直接放在从10'000 ppm DMSO储备溶液中制备的水性测试溶液中。将幼苗放置在测试溶液中6天之后,针对死亡率对这些样品进行评估。

[0545] 以下化合物在24ppm测试率下得到至少80%的死亡率:P6和P2。

[0546] 实例B7桃蚜 (绿色桃蚜虫):内在活性

[0547] 将来自10'000ppm DMSO储备溶液的测试化合物通过移液管施用到24孔微量滴定板中并且与蔗糖溶液进行混合。将这些平板用拉伸的Parafilm膜进行封闭。将24孔塑料模板置放在平板上并且将经过侵染的豌豆幼苗直接置放在Parafilm膜上。将经过侵染的平板用凝胶印迹纸与另外的塑料模板进行封闭,并且然后倒置。侵染5天之后,针对死亡率对这些样品进行评估。

[0548] 以下化合物在12ppm测试率下得到至少80%的死亡率:P1和P2。

[0549] 实例B8小菜蛾 (小菜蛾 (Diamond back moth)):摄食/接触活性

[0550] 将具有人工饲料的24孔微量滴定板用从10'000ppm DMSO储备溶液中制备的水性测试溶液通过移液进行处理。在干燥之后,用L2期幼虫对各板进行侵染(10至15只/孔)。侵染5天之后,相比于未处理样品,针对死亡率和生长抑制对这些样品进行评估。

[0551] 以下化合物在200ppm施用率给出了两个类别(死亡率或生长抑制)中至少一个的至少80%的效果:P6、P1和P2。

[0552] 实例B9海灰翅夜蛾 (埃及棉叶虫):摄食/接触活性

[0553] 将棉花叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并且用从10'000ppm DMSO储备溶液中制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后,将叶圆片用五只L1期幼虫进行侵染。侵染3天之后,相比于未处理样品,针对死亡率、拒食效果以及生长抑制对这些样品进行评估。测试样品对海灰翅夜蛾的控制为在死亡率、拒食效果、以及生长抑制中的至少一个比未处理样品更高时。

[0554] 以下化合物在200ppm施用率下得到至少80%的控制:P6、P5、P1和 P2。

[0555] 实例B10海灰翅夜蛾 (埃及棉叶虫):系统活性

[0556] 将测试化合物用移液管从10'000ppm DMSO储备溶液施用到24孔板中并且与琼脂进行混合。将莴苣种子置于琼脂上并且用另一块也包含琼脂的平板封闭该多孔板。7天之后,根已经将化合物吸收并且莴苣已经生长进入盖平板。现在将这些莴苣叶切到盖平板中。将夜蛾属卵吸移穿过潮湿凝胶印记纸上的塑料模板及其所封闭的平板。侵染6天之后,相比于未处理样品,针对死亡率、拒食效果以及生长抑制对这些样品进行评估。

[0557] 以下化合物在12.5ppm测试比率下给出了三个类别(死亡率、拒食效果、或生长抑制)中的至少一个的至少80%的效果:P6和P2。

[0558] 实例B11二点叶螨 (二斑叶螨):摄食/接触活性

[0559] 将24孔微量滴定板中的琼脂上的豆叶圆片用从10'000ppm DMSO储备溶液中制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后,将叶圆片用混合年龄的螨种群进行侵染。侵染8天之后,针对混合种群(流动平台)的死亡率对这些样品进行评估。

[0560] 以下化合物在200ppm施用率下得到至少80%的死亡率:P4。

[0561] 实例B12埃及伊蚊 (黄热病蚊子):摄食/接触活性

[0562] 将10至15只伊蚊幼虫(L2期)连同营养混合物置于96孔微量滴定板中。将测试化合物用移液管吸取到这些孔中。在孵育2天时间之后,针对死亡率和生长抑制对昆虫进行评估。

[0563] 以下化合物在5ppm测试比率给出了两个类别(死亡率或生长抑制)中至少一个的

至少80%的效果:P2。