



(21) 申請案號：109146862

(22) 申請日：中華民國 109 (2020) 年 12 月 30 日

(51) Int. Cl. :

C07D471/04 (2006.01)

A01N43/90 (2006.01)

A01N43/36 (2006.01)

A01N43/40 (2006.01)

A01N59/02 (2006.01)

A01N53/00 (2006.01)

A01P5/00 (2006.01)

A01P7/00 (2006.01)

A01P9/00 (2006.01)

(30) 優先權：2019/12/31 印度

201911054729

(71) 申請人：瑞士商先正達農作物保護公司 (瑞士) SYNGENTA CROP PROTECTION AG (CH)
瑞士(72) 發明人：席克維爾 維卡司 SIKERVAR, VIKAS (IN)；山恩 印迪拉 SEN, INDIRA (IN)；
慕勒巴哈 米歇爾 MUEHLEBACH, MICHEL (CH)；韓德勒 塞巴斯蒂安
RENDLER, SEBASTIAN (DE)；斯托勒 安德烈 STOLLER, ANDRE (CH)；艾米
瑞 丹尼 EMERY, DANIEL (CH)；布賀胡茲 安格 BUCHHOLZ, ANKE (DE)；
克茲 貝內迪克特 KURTZ, BENEDIKT (DE)

(74) 代理人：閻啓泰；林景郁

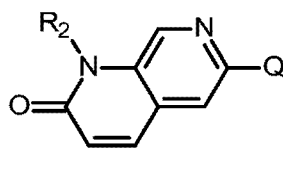
申請實體審查：無 申請專利範圍項數：22 項 圖式數：0 共 212 頁

(54) 名稱

具有含硫取代基的殺有害生物活性之雜環衍生物

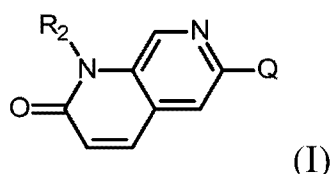
(57) 摘要

揭露了具有式 (I) 之化合物



其中取代基係如請求項 1 中定義的。此外，本發明關於包含具有式 (I) 之化合物的農用化學組成物、關於該等組成物的製備、並且關於該等化合物或組成物在農業或園藝中用於對抗、預防或控制動物有害生物之用途，該動物有害生物包括節肢動物並且特別是昆蟲、線蟲、軟體動物或蟎蟲目的代表。

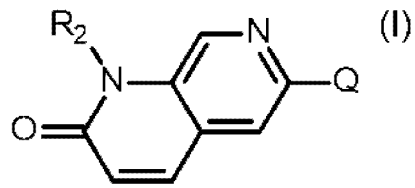
Compounds of the formula (I)



wherein the substituents are as defined in claim 1. Furthermore, the present invention relates to agrochemical compositions which comprise compounds of formula (I), to preparation of these compositions, and to the

use of the compounds or compositions in agriculture or horticulture for combating, preventing or controlling animal pests, including arthropods and in particular insects, nematodes, molluscs or representatives of the order Acarina.

特徵化學式：





202136256

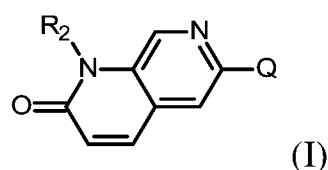
【發明摘要】

【中文發明名稱】 具有含硫取代基的殺有害生物活性之雜環衍生物

【英文發明名稱】 Pesticidally active heterocyclic derivatives with sulfur containing substituents

【中文】

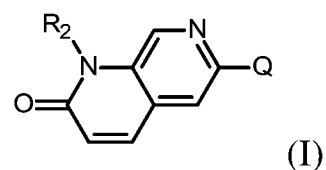
揭露了具有式 (I) 之化合物



其中取代基係如請求項1中定義的。此外，本發明關於包含具有式 (I) 之化合物的農用化學組成物、關於該等組成物的製備、並且關於該等化合物或組成物在農業或園藝中用於對抗、預防或控制動物有害生物之用途，該動物有害生物包括節肢動物並且特別是昆蟲、線蟲、軟體動物或蟬蟎目的代表。

【英文】

Compounds of the formula (I)



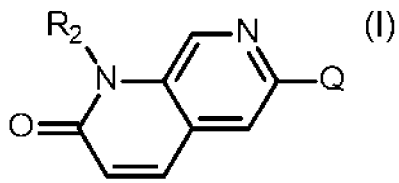
wherein the substituents are as defined in claim 1. Furthermore, the present invention relates to agrochemical compositions which comprise compounds of formula (I), to preparation of these compositions, and to the use of the compounds or compositions in agriculture or horticulture for combating, preventing or controlling animal pests, including arthropods and in particular insects, nematodes, molluscs or representatives of the order *Acarina*.

【指定代表圖】 無

【代表圖之符號簡單說明】

無

【特徵化學式】



【發明說明書】

- 【中文發明名稱】 具有含硫取代基的殺有害生物活性之雜環衍生物
- 【英文發明名稱】 Pesticidally active heterocyclic derivatives with sulfur containing substituents

【技術領域】

【0001】 本發明關於含有硫取代基的殺有害生物活性（特別是殺昆蟲活性）的雜環衍生物、關於其製備方法、關於包含那些化合物的組成物、並且關於它們用於控制動物有害生物（包括節肢動物並且特別是昆蟲或蜱蟎目的代表）之用途。

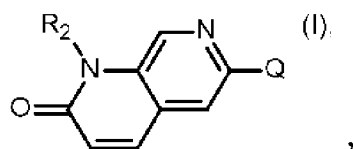
【先前技術】

【0002】 具有殺有害生物作用的雜環化合物係已知的並描述於例如WO 2013191112中。

【發明內容】

【0003】 現在已經出人意料地發現，某些具有含硫取代基的新穎的殺有害生物活性衍生物作為殺有害生物劑具有有利的特性。

【0004】 因此本發明提供了具有式I之化合物，



其中

R₂係C₁-C₆鹵代烷基；

Q係選自由以下組成之群組的基團：式Qa和Qb

每個R₄獨立地是氫、C₁-C₄烷基或C₃-C₆環烷基；並且

R₅係C₁-C₆烷基、C₁-C₆鹵代烷基或C₃-C₆環烷基。

【0005】 本發明還提供了具有式I之化合物的農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物和N-氧化物。

【0006】 具有至少一個鹼性中心的具有式I之化合物可以例如與以下形成例如酸加成鹽：強無機酸（例如礦物酸，例如過氯酸、硫酸、硝酸、亞硝酸、磷酸或氫鹵酸），強有機羧酸（例如未經取代的或例如被鹵素取代的C₁-C₄烷羧酸，例如乙酸，例如飽和或不飽和的二羧酸，例如草酸、丙二酸、琥珀酸、馬來酸、富馬酸或鄰苯二甲酸，例如羥基羧酸，例如抗壞血酸、乳酸、蘋果酸、酒石酸或檸檬酸，或例如苯甲酸），或有機磺酸（例如未經取代的或例如被鹵素取代的C₁-C₄烷磺酸或芳基磺酸，例如甲烷磺酸或對甲苯磺酸）。具有至少一個酸性基團的具有式I之化合物可以例如與鹼形成鹽，例如礦物鹽，例如鹼金屬或鹼土金屬鹽，例如鈉鹽、鉀鹽或鎂鹽；或與氨或有機胺（例如味啉，吡啶，吡咯啶，單、二或三低級烷基胺，例如乙胺、二乙胺、三乙胺或二甲基丙基胺，或單、二或三羥基低級烷基胺，例如單乙醇胺、二乙醇胺或三乙醇胺）形成鹽。

【0007】 在每種情況下，根據本發明的具有式I之化合物係處於游離形式、被氧化的形式如N-氧化物、或鹽的形式（例如農藝學上可用的鹽的形式）。

【0008】 N-氧化物係三級胺的氧化形式或含氮雜芳香族化合物的氧化形式。例如，A. Albini和S. Pietra於1991年在博卡拉頓（Boca Raton）CRC出版社出版的名為「Heterocyclic N-oxides [雜環N-氧化物]」一書中描述了它們。

【0009】 根據本發明的具有式I之化合物還包括在鹽形成期間可能形成的水合物。

【0010】 在取代基被指示為本身被進一步取代時，這意指它們帶有一個或多個相同的或不同的取代基，例如一至四個取代基。通常地，同時存在不多於三

個這樣的視需要的取代基。較佳的是，同時存在不多於兩個這樣的取代基（即，該基團被一個或兩個所指示的取代基取代）。在額外的取代基係較大的基團如環烷基或苯基時，最較佳的是僅存在一個這樣的視需要的取代基。在基團被指示為被取代時，例如烷基，這包括係其他基團的一部分的那些基團，例如烷硫基中的烷基。

【0011】 如本文所用，術語「 C_1-C_n 烷基」係指具有1至n個碳原子、經由任一碳原子附接的飽和直鏈或支鏈烴基，例如以下基團中的任一種：甲基、乙基、正丙基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、正己基、正戊基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基、或1-乙基-2-甲基丙基。

【0012】 如本文所用，術語「 C_1-C_n 鹵代烷基」係指具有1至n個碳原子、經由任一碳原子附接的直鏈或支鏈飽和烷基（如上所提及的），其中該等基團中的一些或全部氫原子可以被氟、氯、溴和/或碘替代，即，例如以下中的任一種：氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、2-氟乙基、2-氯乙基、2-溴乙基、2-碘乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基、2-氟丙基、3-氟丙基、2,2-二氟丙基、2,3-二氟丙基、2-氯丙基、3-氯丙基、2,3-二氯丙基、2-溴丙基、3-溴丙基、3,3,3-三氟丙基、3,3,3-三氯丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、七氟丙基、1-(氟甲基)-2-氟乙基、1-(氯甲基)-2-氯乙基、1-(溴甲基)-2-溴乙基、4-氟丁基、4-氯丁基、4-溴丁基或九氟丁基。相應地，術語「 C_1-C_2 -氟烷基」將是指帶有1、2、3、4、或5個氟原子的 C_1-C_2 -烷基，例如以下中的任一種：二氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、

2,2,2-三氟乙基、1,1,2,2-四氟乙基或五氟乙基。

【0013】 如本文所用，術語「 C_1-C_n 烷氧基」係指具有1至n個碳原子的直鏈或支鏈飽和烷基（如上提及的），該飽和烷基經由氧原子附接，即，例如以下中的任一種：甲氧基、乙氧基、正丙氧基、1-甲基乙氧基、正丁氧基、1-甲基丙氧基、2-甲基丙氧基或1,1-二甲基乙氧基。

【0014】 如本文所用，術語「 C_1-C_n 鹵代烷氧基」係指如上所提及的 C_1-C_n 烷氧基，其部分或全部被氟、氯、溴和/或碘取代，即，例如以下中的任一種：氯甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2-溴乙氧基、2-碘乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、五氟乙氧基、2-氟丙氧基、3-氟丙氧基、2,2-二氟丙氧基、2,3-二氟丙氧基、2-氯丙氧基、3-氯丙氧基、2,3-二氯丙氧基、2-溴丙氧基、3-溴丙氧基、3,3,3-三氟丙氧基、3,3,3-三氯丙氧基、2,2,3,3,3-五氟丙氧基、七氟丙氧基、1-(氟甲基)-2-氟乙氧基、1-(氯甲基)-2-氯乙氧基、1-(溴甲基)-2-溴乙氧基、4-氟丁氧基、4-氯丁氧基、或4-溴丁氧基。

【0015】 如本文所用，術語「 C_1-C_n 烷基氫硫基」係指具有1至n個碳原子的直鏈或支鏈飽和烷基（如上所提及的），該飽和烷基經由硫原子附接，即，例如以下中的任一種：甲硫基、乙硫基、正丙硫基、1-甲基乙硫基、丁硫基、1-甲基丙硫基、2-甲基丙硫基或1,1-二甲基乙硫基。

【0016】 如本文所用，術語「 C_1-C_n 烷基亞磺醯基」係指具有1至n個碳原子的直鏈或支鏈飽和烷基（如上所提及的），其經由亞磺醯基的硫原子附接，即，例如以下中的任一種：甲基亞磺醯基、乙基亞磺醯基、正丙基亞磺醯基、1-甲基乙基-亞磺醯基、正丁基亞磺醯基、1-甲基丙基亞磺醯基、2-甲基丙基亞磺醯基、1,1-二甲基-乙基亞磺醯基、正戊基亞磺醯基、1-甲基丁基亞磺醯基、2-甲基丁基

亞磺醯基、3-甲基-丁基亞磺醯基、1,1-二甲基丙基亞磺醯基、1,2-二甲基丙基亞磺醯基、2,2-二甲基丙基亞磺醯基或1-乙基丙基亞磺醯基。

【0017】 如本文所用，術語「 C_1-C_n 烷基磺醯基」係指具有1至n個碳原子的直鏈或支鏈飽和烷基（如上所提及的），其經由磺醯基的硫原子附接，即，例如以下中的任一種：甲基磺醯基、乙基磺醯基、正丙基磺醯基、異丙基磺醯基、正丁基磺醯基、1-甲基丙基磺醯基、2-甲基丙基磺醯基或三級丁基磺醯基。

【0018】 如本文所用，術語「 C_1-C_n 氰基烷基」係指具有1至n個碳原子的直鏈或支鏈飽和烷基（如上所提及的），其被氰基取代，例如氰基亞甲基、氰基伸乙基、1,1-二甲基氰基甲基、氰基甲基、氰基乙基和1-二甲基氰基甲基。

【0019】 術語「 C_1-C_n 氰基烷氧基」係指上述的但是經由氧原子附接的基團。

【0020】 如本文所用，在術語（如「 C_3-C_n 環烷基」）後的後綴「 $-C_1-C_n$ 烷基」（其中n係從1-6的整數）係指被 C_3-C_n 環烷基取代的直鏈或支鏈飽和烷基。 C_3-C_n 環烷基- C_1-C_n 烷基的實例係例如環丙基甲基。

【0021】 如本文所用，術語「 C_3-C_6 環烷基」係指3-6員環烷基，如環丙烷、環丁烷、環丙烷、環戊烷和環己烷。

【0022】 鹵素通常是氟、氯、溴或碘。這也相應地適用於與其他含義組合的鹵素，如鹵代烷基。

【0023】 在本發明的上下文中，取代基定義中的「單取代或多取代的」典型地意指，取決於取代基的化學結構，單取代的到五次取代的，更較佳的是單、二或三取代的。

【0024】 在本發明的上下文中，視情況而定，短語「 Q_1 係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環...」，和「 Q_1 係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環...」係指視

情況而定，取代基 Q_1 的具體實施方式與如由式Qa或式Qb表示的基團Q的附接方式。

【0025】 在本發明的上下文中，「 Q_1 係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環，...，並且所述環系統可以含有1、2或3個雜原子」的實例係但不限於苯基、吡啶基、三唑基、吡啶基和嘧啶基；較佳的是，苯基、2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、嘧啶-2-基、嘧啶-4-基、以及嘧啶-5-基。

【0026】 在本發明的上下文中，「 Q_1 係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環，...，並且所述環系統含有1、2或3個雜原子」的實例係但不限於吡啶基、吡咯基、咪唑基和三唑基；較佳的是，吡咯-1-基、吡啶-1-基、三唑-2-基、1,2,4-三唑-1-基、三唑-1-基、和咪唑-1-基。

【0027】 提供了根據本發明的某些實施方式，如下面列出的。

【0028】 實施方式1提供了如上定義的具有式I之化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物。

【0029】 實施方式2提供了根據實施方式1（其中Q係Qa）並且具有如下列出的 R_2 、A、X、 R_1 、 Q_1 、 R_4 、 R_5 和 R_3 的較佳的值的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物。

【0030】 實施方式3提供了根據實施方式1（其中Q係Qb）並且具有如下列出的 R_2 、A、X、 R_1 、 Q_1 、 R_4 、 R_5 和 R_3 的較佳的值的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物。

【0031】 關於實施方式1-3， R_2 、A、X、 R_1 、 Q_1 、 R_4 、 R_5 和 R_3 的較佳的值係以其任何組合如下列出的：

【0032】 較佳的是， R_2 係 C_1 - C_6 鹵代烷基。

【0033】 更較佳的是， R_2 係 C_1 - C_6 氟烷基。

【0034】 甚至更較佳的是， R_2 係 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CHF}_2$ 或 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$ 。

【0035】 最較佳的是， R_2 係 $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$ 或 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 。

【0036】 較佳的是，A係N。

【0037】 較佳的是，X係S或 SO_2 。

【0038】 最較佳的是，X係 SO_2 。

【0039】 較佳的是， R_1 係 C_1 - C_4 烷基或環丙基- C_1 - C_4 烷基。

【0040】 更較佳的是， R_1 係乙基或環丙基甲基。

【0041】 最較佳的是， R_1 係乙基。

【0042】 較佳的是， Q_1 係氫、鹵素、 C_1 - C_6 鹵代烷基、 C_3 - C_6 環烷基、被氰基單取代的 C_3 - C_6 環烷基、 C_1 - C_6 氰基烷基、 C_1 - C_6 鹵代烷氧基、 $-\text{N}(\text{R}_4)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}_4)\text{COR}_5$ 、或 $-\text{N}(\text{R}_4)\text{CON}(\text{R}_4)_2$ 、(呋啶-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或

Q_1 係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和 C_1 - C_4 鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；或

Q_1 係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和 C_1 - C_4 鹵代烷基；並且所述環系統含有2或3個環氮原子。

【0043】 更較佳的是， Q_1 係氫、鹵素、三氟甲基、環丙基、氰基環丙基、氰基異丙基、三氟乙氧基、 $-\text{N}(\text{R}_4)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}_4)\text{COR}_5$ 、或 $-\text{N}(\text{R}_4)\text{CON}(\text{R}_4)_2$ ，在其中的每一個中， R_4 獨立地是氫或甲基並且 R_5 係甲基或環丙基，或 Q_1 係(呋啶-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、未取代的或被氫、氰基或三氟甲基單取代的N-連接的吡啶基，或 Q_1 係N-連接的三唑基或C-連接的嘧啶基。

【0044】 更較佳的是， Q_1 係氫、氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙

基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{CH}_3)$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{NHCOCH}_3$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)\text{COCH}_3$ 、 $-\text{NHCO}$ (環丙基)、 $-\text{N}(\text{CH}_3)\text{CO}$ (環丙基)、 $-\text{N}(\text{H})\text{CONH}_2$ 、 $-\text{N}(\text{H})\text{CONH}(\text{CH}_3)$ 、 $-\text{N}(\text{H})\text{CON}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)\text{CONH}_2$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)\text{CONH}(\text{CH}_3)$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)\text{CON}(\text{CH}_3)_2$ 、(呋啶-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

【0045】 最較佳的是， Q_1 係氫、氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、 $-\text{NH}(\text{CH}_3)$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)\text{COCH}_3$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)\text{CO}$ (環丙基)、 $-\text{N}(\text{H})\text{CONH}(\text{CH}_3)$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)\text{CONH}(\text{CH}_3)$ 、(呋啶-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

【0046】 較佳的是，每個 R_4 獨立地是氫或 C_1 - C_4 烷基。

【0047】 最較佳的是，每個 R_4 獨立地是氫或甲基。

【0048】 較佳的是， R_5 係 C_1 - C_6 烷基或 C_3 - C_6 環烷基。

【0049】 更較佳的是， R_5 係甲基、乙基或環丙基。

【0050】 更較佳的是， R_5 係甲基或環丙基。

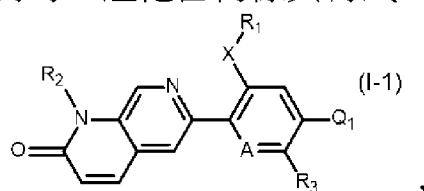
【0051】 最較佳的是， R_5 係甲基。

【0052】 較佳的是， R_3 係氫或 C_1 - C_4 烷基。

【0053】 更較佳的是， R_3 係氫或甲基。

【0054】 最較佳的是， R_3 係氫。

【0055】 根據本發明的一組化合物係具有式I-1的那些



其中A、X、 R_1 、和 R_2 係如對於具有式I之化合物(上文)定義的，或其農用

第9頁，共197頁(發明說明書)

化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，並且其中Q₁較佳的是係氫、鹵素、C₁-C₆鹵代烷基、C₃-C₆環烷基、被氰基單取代的C₃-C₆環烷基、C₁-C₆氰基烷基、C₁-C₆鹵代烷氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、或-N(R₄)CON(R₄)₂、(咪唑啉-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或

Q₁係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；或

Q₁係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統含有2或3個環氮原子；

R₃較佳的是係氫或C₁-C₄烷基；

較佳的是，每個R₄獨立地是氫或C₁-C₄烷基；並且

R₅較佳的是係C₁-C₆烷基或C₃-C₆環烷基。

【0056】 具有式I-1的化合物中的A、X、R₁、和R₂的較佳的定義係如對於具有式I之化合物（上文）定義的，並且更較佳的是，Q₁係氫、鹵素、三氟甲基、環丙基、氰基環丙基、氰基異丙基、三氟乙氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、或-N(R₄)CON(R₄)₂，在其中的每一個中，R₄獨立地是氫或甲基並且R₅係甲基、乙基或環丙基；較佳的是甲基或環丙基，或Q₁係(咪唑啉-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、未取代的或被氯、氰基或三氟甲基單取代的N-連接的吡啶基，或Q₁係N-連接的三唑基或C-連接的嘧啶基；並且R₃係氫或甲基、較佳的是氫。

【0057】 根據此實施方式的一組化合物係具有式 (I-1a) 之化合物，其係具有式 (I-1) 之化合物，其中A係N。

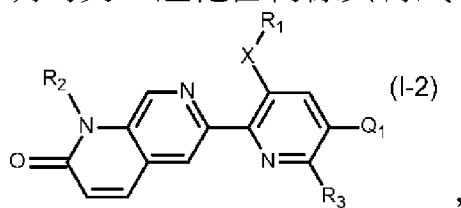
【0058】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-1b) 之化合物，其係具有式 (I-1) 之化合物，其中A係CH。

【0059】 根據此實施方式的一組化合物係具有式 (I-1c) 之化合物，其係具有式 (I-1) 之化合物，其中 R_2 係 C_1 - C_6 氟烷基；較佳的是， R_2 係 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHF_2$ ；更較佳的是， R_2 係 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$ 。

【0060】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-1d) 之化合物，其係具有式 (I-1) 之化合物，其中X係S或 SO_2 ；較佳的是，X係 SO_2 。

【0061】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-1e) 之化合物，其係具有式 (I-1) 之化合物，其中 R_1 係 C_1 - C_4 烷基或環丙基- C_1 - C_4 烷基；較佳的是， R_1 係乙基或環丙基甲基；更較佳的是， R_1 係乙基。

【0062】 根據本發明的另一組化合物係具有式I-2的那些



其中X、 R_1 和 R_2 係如對於具有式I之化合物（上文）定義的，或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，並且其中 Q_1 較佳的是係氫、鹵素、 C_1 - C_6 鹵代烷基、 C_3 - C_6 環烷基、被氰基單取代的 C_3 - C_6 環烷基、 C_1 - C_6 氰基烷基、 C_1 - C_6 鹵代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(嘔啞啞-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或

Q_1 係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和 C_1 - C_4 鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；或

Q_1 係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和 C_1 - C_4 鹵代烷基；並且所述環系統含有2或3個環氮原子；

R_3 較佳的是係氫或 C_1 - C_4 烷基；

較佳的是，每個 R_4 獨立地是氫或 C_1 - C_4 烷基；並且

R_5 較佳的是係 C_1 - C_6 烷基或 C_3 - C_6 環烷基。

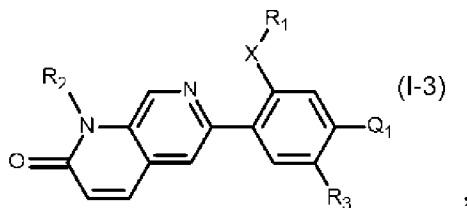
【0063】 具有式I-2的化合物中的X、 R_1 和 R_2 的較佳的定義係如對於具有式I之化合物（上文）定義的，並且更較佳的是， Q_1 係氫、鹵素、三氟甲基、環丙基、氰基環丙基、氰基異丙基、三氟乙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ ，在其中的每一個中， R_4 獨立地是氫或甲基並且 R_5 係甲基、乙基或環丙基；較佳的是甲基或環丙基，或 Q_1 係(呋啶-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、未取代的或被氯、氰基或三氟甲基單取代的N-連接的吡啶基，或 Q_1 係N-連接的三唑基或C-連接的嘧啶基；並且 R_3 係氫或甲基、較佳的是氫。

【0064】 根據此實施方式的一組化合物係具有式 (I-2a) 之化合物，其係具有式 (I-2) 之化合物，其中X係S或 SO_2 ，較佳的是X係 SO_2 。

【0065】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-2b) 之化合物，其係具有式 (I-2) 之化合物，其中 R_1 係 C_1 - C_4 烷基或環丙基- C_1 - C_4 烷基，較佳的是 R_1 係乙基或環丙基甲基；更較佳的是， R_1 係乙基。

【0066】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-2c) 之化合物，其係具有式 (I-2) 之化合物，其中 R_2 係 C_1 - C_6 氟烷基；較佳的是， R_2 係 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHF_2$ ；更較佳的是， R_2 係 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$ 。

【0067】 根據本發明的另一組化合物係具有式I-3的那些



其中X、 R_1 和 R_2 係如對於具有式I之化合物（上文）定義的，或其農用化學上

可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，並且其中Q₁較佳的是係氫、鹵素、C₁-C₆鹵代烷基、C₃-C₆環烷基、被氰基單取代的C₃-C₆環烷基、C₁-C₆氰基烷基、C₁-C₆鹵代烷氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、或-N(R₄)CON(R₄)₂、(呋啞啉-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或

Q₁係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；或

Q₁係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統含有2或3個環氮原子；

R₃較佳的是係氫或C₁-C₄烷基；

較佳的是，每個R₄獨立地是氫或C₁-C₄烷基；並且

R₅較佳的是係C₁-C₆烷基或C₃-C₆環烷基。

【0068】 具有式I-3的化合物中的X、R₁和R₂的較佳的定義係如對於具有式I之化合物（上文）定義的，並且更較佳的是，Q₁係氫、鹵素、三氟甲基、環丙基、氰基環丙基、氰基異丙基、三氟乙氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、或-N(R₄)CON(R₄)₂，在其中的每一個中，R₄獨立地是氫或甲基並且R₅係甲基、乙基或環丙基；較佳的是甲基或環丙基，或Q₁係(呋啞啉-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、未取代的或被氯、氰基或三氟甲基單取代的N-連接的吡啶基，或Q₁係N-連接的三唑基或C-連接的嘧啶基；並且R₃係氫或甲基、較佳的是氫。

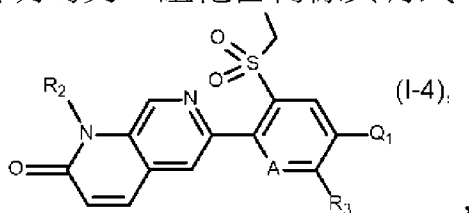
【0069】 根據此實施方式的一組化合物係具有式 (I-3a) 之化合物，其係具有式 (I-3) 之化合物，其中X係S或SO₂，較佳的是X係SO₂。

【0070】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-3b) 之化合物，其係具有式 (I-3) 之化合物，其中R₁係C₁-C₄烷基或環丙基-C₁-C₄烷基，較佳的是R₁

係乙基或環丙基甲基；更較佳的是， R_1 係乙基。

【0071】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-3c) 之化合物，其係具有式 (I-3) 之化合物，其中 R_2 係 C_1 - C_6 氟烷基；較佳的是， R_2 係 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHF_2$ ；更較佳的是， R_2 係 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$ 。

【0072】 根據本發明的另一組化合物係具有式I-4的那些



其中

A係CH或N、較佳的是N；

R_2 係 C_1 - C_6 鹵代烷基，較佳的是 R_2 係 C_1 - C_6 氟烷基，更較佳的是 R_2 係 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHF_2$ ；

R_3 係氫或 C_1 - C_4 烷基、較佳的是氫或甲基；

Q_1 係氫、鹵素、 C_1 - C_6 鹵代烷基、 C_3 - C_6 環烷基、被氰基單取代的 C_3 - C_6 環烷基、 C_1 - C_6 氰基烷基、 C_1 - C_6 鹵代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(啞唑啉-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或

Q_1 係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和 C_1 - C_4 鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；或

Q_1 係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和 C_1 - C_4 鹵代烷基；並且所述環系統含有2或3個環氮原子；

每個 R_4 獨立地是氫或 C_1 - C_4 烷基、較佳的是氫或甲基；並且

R_5 係 C_1 - C_6 烷基或 C_3 - C_6 環烷基，較佳的是甲基、乙基或環丙基，更較佳的是甲基或環丙基；或

其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物。

【0073】 根據此實施方式的一組進一步較佳的化合物係具有式 (I-4a) 之化合物，其係具有式 (I-4) 之化合物，其中A係N。

【0074】 根據此實施方式的另一組較佳的化合物係具有式 (I-4b) 之化合物，其係具有式 (I-4) 之化合物，其中A係CH。

【0075】 根據此實施方式的一組進一步較佳的化合物係具有式 (I-4c) 之化合物，其係具有式 (I-4) 之化合物，其中 R_3 係氫。

【0076】 根據此實施方式的另一組較佳的化合物係具有式 (I-4d) 之化合物，其係具有式 (I-4) 之化合物，其中 R_3 係 C_1 - C_4 烷基、較佳的是甲基。

【0077】 根據此實施方式的一組進一步較佳的化合物係具有式 (I-4e) 之化合物，其係具有式 (I-4) 之化合物，其中A係N並且 R_3 係氫。

【0078】 根據此實施方式的一組進一步較佳的化合物係具有式 (I-4f) 之化合物，其係具有式 (I-4) 之化合物，其中 Q_1 係氫、鹵素、三氟甲基、環丙基、氰基環丙基、氰基異丙基、三氟乙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ ，在其中的每一個中， R_4 獨立地是氫或甲基並且 R_5 係甲基、乙基或環丙基，或 Q_1 係(吡啶啉-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；較佳的是， Q_1 係氫、氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHCOCH_3$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-NHCO$ (環丙基)、 $-N(CH_3)CO$ (環丙基)、 $-N(H)CONH_2$ 、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(H)CON(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)CONH_2$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CON(CH_3)_2$ 、(吡啶啉-2-酮)-3-基、或2-吡啶基氧基；更較佳的是， Q_1 係氫、氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲

基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、 $-\text{NH}(\text{CH}_3)$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)\text{COCH}_3$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)\text{CO}$ (環丙基)、 $-\text{N}(\text{H})\text{CONH}(\text{CH}_3)$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)\text{CONH}(\text{CH}_3)$ 、(呋啉-2-酮)-3-基、或2-吡啶基氧基。

【0079】 根據此實施方式的一組進一步較佳的化合物係具有式 (I-4g) 之化合物，其係具有式 (I-4) 之化合物，其中 Q_1 係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和 C_1 - C_4 鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；較佳的是， Q_1 係C-連接的嘧啶基；更較佳的是， Q_1 係嘧啶-2-基。

【0080】 根據此實施方式的一組進一步較佳的化合物係具有式 (I-4h) 之化合物，其係具有式 (I-4) 之化合物，其中 Q_1 係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和 C_1 - C_4 鹵代烷基；並且所述環系統含有2個環氮原子；較佳的是， Q_1 係N-連接的吡啶基，其係未取代的或被氯、氰基或三氟甲基單取代；更較佳的是， Q_1 係吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基或1,2,4-三唑-1-基。

【0081】 根據此實施方式的一組進一步較佳的化合物係具有式 (I-4i) 之化合物，其係具有式 (I-4) 之化合物，其中

A係N；

R_2 係 C_1 - C_6 氟烷基、較佳的是 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$ 或 $-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ ；

R_3 係氫或 C_1 - C_4 烷基、較佳的是氫或甲基；並且

Q_1 係氫、鹵素、三氟甲基、環丙基、氰基環丙基、氰基異丙基、三氟乙氧基、 $-\text{N}(\text{R}_4)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}_4)\text{COR}_5$ 、或 $-\text{N}(\text{R}_4)\text{CON}(\text{R}_4)_2$ ，在其中的每一個中， R_4 獨立地是氫或甲基並且 R_5 係甲基、乙基或環丙基，或 Q_1 係(呋啉-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、未取代的或被氯、氰基或三氟甲基單取代的N-連接的吡啶基，或 Q_1 係N-連接的

三唑基或C-連接的嘧啶基。

【0082】 根據此實施方式的另一組較佳的化合物係具有式 (I-4j) 之化合物，其係具有式 (I-4) 之化合物，其中

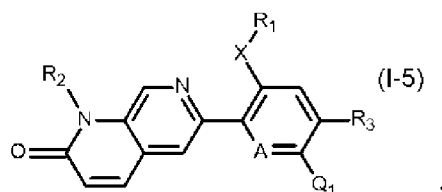
A係N；

R₂係-CH₂CF₂CHF₂或-CH₂CF₂CF₃；

R₃係氫；並且

Q₁係氫、氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、-NH₂、-NH(CH₃)、-N(CH₃)₂、-NHCOCH₃、-N(CH₃)COCH₃、-NHCO(環丙基)、-N(CH₃)CO(環丙基)、-N(H)CONH₂、-N(H)CONH(CH₃)、-N(H)CON(CH₃)₂、-N(CH₃)CONH₂、-N(CH₃)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CON(CH₃)₂、(呋唑啉-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基；較佳的是，Q₁係氫、氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N(CH₃)CO(環丙基)、-N(H)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CONH(CH₃)、(呋唑啉-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

【0083】 根據本發明的一組化合物係具有式I-5的那些



其中A、X、R₁、和R₂係如對於具有式I之化合物（上文）定義的，或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，並且其中Q₁較佳的是係氫、鹵素、C₁-C₆鹵代烷基、C₃-C₆環烷基、被氰基單取代的C₃-C₆環烷基、C₁-C₆氰基烷基、C₁-C₆鹵代烷氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、或-N(R₄)CON(R₄)₂、(呋唑啉-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或

第 17 頁，共 197 頁(發明說明書)

Q_1 係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和 C_1 - C_4 鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；或

Q_1 係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和 C_1 - C_4 鹵代烷基；並且所述環系統含有2或3個環氮原子；

R_3 較佳的是係氫或 C_1 - C_4 烷基；

較佳的是，每個 R_4 獨立地是氫或 C_1 - C_4 烷基；並且

R_5 較佳的是係 C_1 - C_6 烷基或 C_3 - C_6 環烷基。

【0084】 具有式I-5的化合物中的A、X、 R_1 、和 R_2 的較佳的定義係如對於具有式I之化合物（上文）定義的，並且更較佳的是， Q_1 係氫、鹵素、三氟甲基、環丙基、氰基環丙基、氰基異丙基、三氟乙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ ，在其中的每一個中， R_4 獨立地是氫或甲基並且 R_5 係甲基、乙基或環丙基；較佳的是甲基或環丙基，或 Q_1 係(呋啶-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、未取代的或被氫、氰基或三氟甲基單取代的N-連接的吡啶基，或 Q_1 係N-連接的三唑基或C-連接的嘧啶基；並且 R_3 係氫或甲基、較佳的是氫。

【0085】 根據此實施方式的一組化合物係具有式 (I-5a) 之化合物，其係具有式 (I-5) 之化合物，其中A係N。

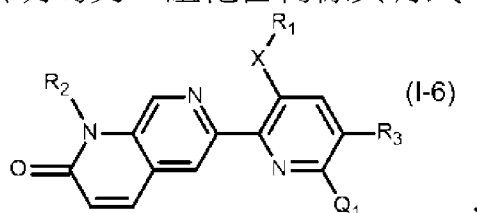
【0086】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-5b) 之化合物，其係具有式 (I-5) 之化合物，其中A係CH。

【0087】 根據此實施方式的一組化合物係具有式 (I-5c) 之化合物，其係具有式 (I-5) 之化合物，其中 R_2 係 C_1 - C_6 氟烷基；較佳的是， R_2 係 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHF_2$ ；更較佳的是， R_2 係 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$ 。

【0088】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-5d) 之化合物，其係具有式 (I-5) 之化合物，其中X係S或SO₂；較佳的是，X係SO₂。

【0089】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-5e) 之化合物，其係具有式 (I-5) 之化合物，其中R₁係C₁-C₄烷基或環丙基-C₁-C₄烷基；較佳的是，R₁係乙基或環丙基甲基；更較佳的是，R₁係乙基。

【0090】 根據本發明的另一組化合物係具有式I-6的那些



其中X、R₁和R₂係如對於具有式I之化合物（上文）定義的，或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，並且其中Q₁較佳的是係氫、鹵素、C₁-C₆鹵代烷基、C₃-C₆環烷基、被氰基單取代的C₃-C₆環烷基、C₁-C₆氰基烷基、C₁-C₆鹵代烷氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、或-N(R₄)CON(R₄)₂、(呋啉-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或

Q₁係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；或

Q₁係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統含有2或3個環氮原子；

R₃較佳的是係氫或C₁-C₄烷基；

較佳的是，每個R₄獨立地是氫或C₁-C₄烷基；並且

R₅較佳的是係C₁-C₆烷基或C₃-C₆環烷基。

【0091】 具有式I-6的化合物中的X、R₁和R₂的較佳的定義係如對於具有式

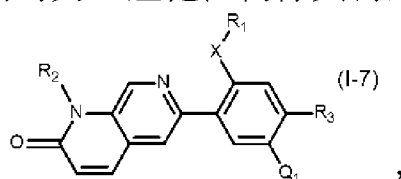
I之化合物（上文）定義的，並且更較佳的是， Q_1 係氫、鹵素、三氟甲基、環丙基、氰基環丙基、氰基異丙基、三氟乙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ ，在其中的每一個中， R_4 獨立地是氫或甲基並且 R_5 係甲基、乙基或環丙基；較佳的是甲基或環丙基，或 Q_1 係(呋啶-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、未取代的或被氫、氰基或三氟甲基單取代的N-連接的吡啶基，或 Q_1 係N-連接的三唑基或C-連接的嘧啶基；並且 R_3 係氫或甲基、較佳的是氫。

【0092】 根據此實施方式的一組化合物係具有式 (I-6a) 之化合物，其係具有式 (I-6) 之化合物，其中X係S或 SO_2 ，較佳的是X係 SO_2 。

【0093】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-6b) 之化合物，其係具有式 (I-6) 之化合物，其中 R_1 係 C_1 - C_4 烷基或環丙基- C_1 - C_4 烷基，較佳的是 R_1 係乙基或環丙基甲基；更較佳的是， R_1 係乙基。

【0094】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-6c) 之化合物，其係具有式 (I-6) 之化合物，其中 R_2 係 C_1 - C_6 氟烷基；較佳的是， R_2 係 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHF_2$ ；更較佳的是， R_2 係 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$ 。

【0095】 根據本發明的另一組化合物係具有式I-7的那些



其中X、 R_1 和 R_2 係如對於具有式I之化合物（上文）定義的，或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，並且其中 Q_1 較佳的是係氫、鹵素、 C_1 - C_6 鹵代烷基、 C_3 - C_6 環烷基、被氰基單取代的 C_3 - C_6 環烷基、 C_1 - C_6 氰基烷基、 C_1 - C_6 鹵代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(呋啶-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或

Q_1 係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由碳原子連接至含有取代基

A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；或

Q₁係五員芳香族環系統，所述環系統經由氮原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統含有2或3個環氮原子；

R₃較佳的是係氫或C₁-C₄烷基；

較佳的是，每個R₄獨立地是氫或C₁-C₄烷基；並且

R₅較佳的是係C₁-C₆烷基或C₃-C₆環烷基。

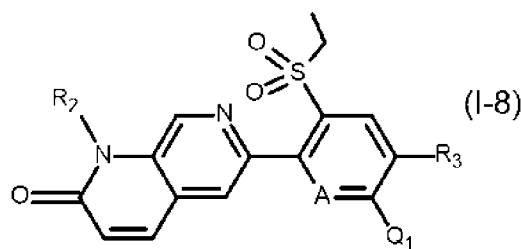
【0096】 具有式I-7的化合物中的X、R₁和R₂的較佳的定義係如對於具有式I之化合物（上文）定義的，並且更較佳的是，Q₁係氫、鹵素、三氟甲基、環丙基、氰基環丙基、氰基異丙基、三氟乙氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、或-N(R₄)CON(R₄)₂，在其中的每一個中，R₄獨立地是氫或甲基並且R₅係甲基、乙基或環丙基；較佳的是甲基或環丙基，或Q₁係(嘔啞啞-2-酮)-3-基、2-吡啞基氧基、未取代的或被氯、氰基或三氟甲基單取代的N-連接的吡啞基，或Q₁係N-連接的三唑基或C-連接的嘧啞基；並且R₃係氫或甲基、較佳的是氫。

【0097】 根據此實施方式的一組化合物係具有式 (I-7a) 之化合物，其係具有式 (I-7) 之化合物，其中X係S或SO₂，較佳的是X係SO₂。

【0098】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-7b) 之化合物，其係具有式 (I-7) 之化合物，其中R₁係C₁-C₄烷基或環丙基-C₁-C₄烷基，較佳的是R₁係乙基或環丙基甲基；更較佳的是，R₁係乙基。

【0099】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-7c) 之化合物，其係具有式 (I-7) 之化合物，其中R₂係C₁-C₆氟烷基；較佳的是，R₂係-CH₂CF₂CF₃、-CH₂CF₂CHF₂、-CH₂CF₃、-CH₂CHF₂或-CH₂CF₂CHF₂CF₃；更較佳的是，R₂係-CH₂CF₂CHF₂或-CH₂CF₂CF₃。

【0100】 根據本發明的另一組化合物係具有式I-8的那些



其中

A係CH或N、較佳的是N；

R₂係C₁-C₆鹵代烷基，較佳的是R₂係C₁-C₆氟烷基，更較佳的是R₂係-CH₂CF₂CF₃、-CH₂CF₂CHF₂、-CH₂CF₃、-CH₂CHF₂或-CH₂CF₂CHF₂CF₃；

R₃係氫或C₁-C₄烷基、較佳的是氫或甲基；

Q₁係氫、鹵素、C₁-C₆鹵代烷基、C₃-C₆環烷基、被氰基單取代的C₃-C₆環烷基、C₁-C₆氰基烷基、C₁-C₆鹵代烷氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、或-N(R₄)CON(R₄)₂、(噁唑啉-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或

Q₁係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；或

Q₁係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統含有2或3個環氮原子；

每個R₄獨立地是氫或C₁-C₄烷基、較佳的是氫或甲基；並且

R₅係C₁-C₆烷基或C₃-C₆環烷基；較佳的是甲基、乙基或環丙基，更較佳的是甲基或環丙基；或

其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物。

【0101】 根據此實施方式的一組進一步較佳的化合物係具有式 (I-8a) 之

化合物，其係具有式 (I-8) 之化合物，其中A係N。

【0102】 根據此實施方式的另一組較佳的化合物係具有式 (I-8b) 之化合物，其係具有式 (I-8) 之化合物，其中A係CH。

【0103】 根據此實施方式的一組進一步較佳的化合物係具有式 (I-8c) 之化合物，其係具有式 (I-8) 之化合物，其中R₃係氫。

【0104】 根據此實施方式的另一組較佳的化合物係具有式 (I-8d) 之化合物，其係具有式 (I-8) 之化合物，其中R₃係C₁-C₄烷基、較佳的是甲基。

【0105】 根據此實施方式的一組進一步較佳的化合物係具有式 (I-8e) 之化合物，其係具有式 (I-8) 之化合物，其中A係N並且R₃係氫。

【0106】 根據此實施方式的一組進一步較佳的化合物係具有式 (I-8f) 之化合物，其係具有式 (I-8) 之化合物，其中Q₁係氫、鹵素、三氟甲基、環丙基、氰基環丙基、氰基異丙基、三氟乙氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、或-N(R₄)CON(R₄)₂，在其中的每一個中，R₄獨立地是氫或甲基並且R₅係甲基、乙基或環丙基，或Q₁係(嘔啞啉-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；較佳的是，Q₁係氫、氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、-NH₂、-NH(CH₃)、-N(CH₃)₂、-NHCOCH₃、-N(CH₃)COCH₃、-NHCO(環丙基)、-N(CH₃)CO(環丙基)、-N(H)CONH₂、-N(H)CONH(CH₃)、-N(H)CON(CH₃)₂、-N(CH₃)CONH₂、-N(CH₃)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CON(CH₃)₂、(嘔啞啉-2-酮)-3-基、或2-吡啶基氧基；更較佳的是，Q₁係氫、氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N(CH₃)CO(環丙基)、-N(H)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CONH(CH₃)、(嘔啞啉-2-酮)-3-基、或2-吡啶基氧基。

【0107】 根據此實施方式的一組進一步較佳的化合物係具有式 (I-8g) 之化合物，其係具有式 (I-8) 之化合物，其中Q₁係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自

由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；較佳的是，Q₁係C-連接的嘧啶基；更較佳的是，Q₁係嘧啶-2-基。

【0108】 根據此實施方式的一組進一步較佳的化合物係具有式 (I-8h) 之化合物，其係具有式 (I-8) 之化合物，其中Q₁係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統含有2個環氮原子；較佳的是，Q₁係N-連接的吡啶基，其係未取代的或被氯、氰基或三氟甲基單取代；更較佳的是，Q₁係吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基或1,2,4-三唑-1-基。

【0109】 根據此實施方式的一組進一步較佳的化合物係具有式 (I-8i) 之化合物，其係具有式 (I-8) 之化合物，其中

A係N；

R₂係C₁-C₆氟烷基、較佳的是-CH₂CF₂CHF₂或-CH₂CF₂CF₃；

R₃係氫或C₁-C₄烷基、較佳的是氫或甲基；並且

Q₁係氫、鹵素、三氟甲基、環丙基、氰基環丙基、氰基異丙基、三氟乙氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、或-N(R₄)CON(R₄)₂，在其中的每一個中，R₄獨立地是氫或甲基並且R₅係甲基或環丙基，或Q₁係(噁唑啉-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、未取代的或被氯、氰基或三氟甲基單取代的N-連接的吡啶基，或Q₁係N-連接的三唑基或C-連接的嘧啶基。

【0110】 根據此實施方式的另一組較佳的化合物係具有式 (I-8j) 之化合物，其係具有式 (I-8) 之化合物，其中

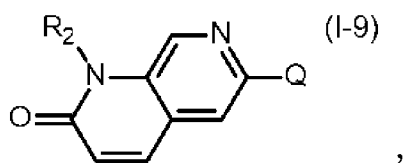
A係N；

R₂係-CH₂CF₂CHF₂或-CH₂CF₂CF₃；

R₃係氫；並且

Q₁係氫、氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、-NH₂、-NH(CH₃)、-N(CH₃)₂、-NHCOCH₃、-N(CH₃)COCH₃、-NHCO(環丙基)、-N(CH₃)CO(環丙基)、-N(H)CONH₂、-N(H)CONH(CH₃)、-N(H)CON(CH₃)₂、-N(CH₃)CONH₂、-N(CH₃)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CON(CH₃)₂、(呋啉啉-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基；較佳的是，Q₁係氫、氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N(CH₃)CO(環丙基)、-N(H)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CONH(CH₃)、(呋啉啉-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

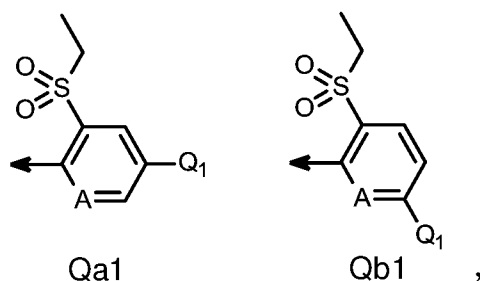
【0111】 根據本發明的一組傑出的化合物係具有式I-9的那些



其中

R₂係C₁-C₆鹵代烷基，較佳的是R₂係C₁-C₆氟烷基，更較佳的是R₂係-CH₂CF₂CF₃、-CH₂CF₂CHF₂、-CH₂CF₃、-CH₂CHF₂或-CH₂CF₂CHF₂CF₃；

Q係選自由以下組成之群組的基團：式Qa1和Qb1



其中箭頭指示與雙環的碳原子的附接點；

並且其中

A係CH或N、較佳的是N；並且

Q₁係氫、鹵素、三氟甲基、環丙基、氰基環丙基、氰基異丙基、三氟乙氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、或-N(R₄)CON(R₄)₂，在其中的每一個中，R₄獨立地是氫或甲基並且R₅係甲基、乙基或環丙基；較佳的是R₅係甲基或環丙基，或Q₁係(噁唑啉-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、未取代的或被氯、氰基或三氟甲基單取代的N-連接的吡啶基，或Q₁係N-連接的三唑基或C-連接的嘧啶基；

較佳的是，Q₁係氫、氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、-NH₂、-NH(CH₃)、-N(CH₃)₂、-NHCOCH₃、-N(CH₃)COCH₃、-NHCO(環丙基)、-N(CH₃)CO(環丙基)、-N(H)CONH₂、-N(H)CONH(CH₃)、-N(H)CON(CH₃)₂、-N(CH₃)CONH₂、-N(CH₃)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CON(CH₃)₂、(噁唑啉-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基；

更較佳的是，Q₁係氫、氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N(CH₃)CO(環丙基)、-N(H)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CONH(CH₃)、(噁唑啉-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

【0112】 根據此實施方式的一組化合物係具有式 (I-9a) 之化合物，其係具有式 (I-9) 之化合物並且是式 (I-9) 之較佳的實施方式中的任一個，其中A係N。

【0113】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-9b) 之化合物，其係具有式 (I-9) 之化合物並且是式 (I-9) 之較佳的實施方式中的任一個，其中A係CH。

【0114】 根據此實施方式的一組化合物係具有式 (I-9c) 之化合物，其係

具有式 (I-9) 之化合物並且是式 (I-9) 之較佳的實施方式中的任一個，其中 R_2 係 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$ 。

【0115】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-9d) 之化合物，其係具有式 (I-9) 之化合物並且是式 (I-9) 之較佳的實施方式中的任一個，其中 Q_1 係氫、鹵素、三氟甲基、環丙基、氰基環丙基、氰基異丙基、三氟乙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ ，在其中的每一個中， R_4 獨立地是氫或甲基並且 R_5 係甲基、乙基或環丙基，或 Q_1 係(噁唑啉-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、未取代的或被氯、氰基或三氟甲基單取代的N-連接的吡啶基，或 Q_1 係N-連接的三唑基或C-連接的嘧啶基；較佳的是， Q_1 係氫、氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (環丙基)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、(噁唑啉-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

【0116】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-9e) 之化合物，其係具有式 (I-9) 之化合物並且是式 (I-9) 之較佳的實施方式中的任一個，其中 Q_1 係氫。

【0117】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-9f) 之化合物，其係具有式 (I-9) 之化合物並且是式 (I-9) 之較佳的實施方式中的任一個，其中 Q_1 係氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (環丙基)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 或 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 。

【0118】 根據此實施方式的另一組化合物係具有式 (I-9g) 之化合物，其係具有式 (I-9) 之化合物並且是式 (I-9) 之較佳的實施方式中的任一個，其中 Q_1 係(噁唑啉-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶

-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

【0119】 根據此實施方式的一組進一步傑出的化合物係具有式 (I-9h) 之化合物，其係具有式 (I-9) 之化合物，其中：

R_2 係-CH₂CF₂CHF₂或-CH₂CF₂CF₃；

Q係選自由以下組成之群組的基團：式Qa1和Qb1，其中

A係N；並且

Q₁係氫、氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、-NH₂、-NH(CH₃)、-N(CH₃)₂、-NHCOCH₃、-N(CH₃)COCH₃、-NHCO(環丙基)、-N(CH₃)CO(環丙基)、-N(H)CONH₂、-N(H)CONH(CH₃)、-N(H)CON(CH₃)₂、-N(CH₃)CONH₂、-N(CH₃)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CON(CH₃)₂、(嘔啶-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

【0120】 根據此實施方式的一組進一步傑出的化合物係具有式 (I-9h-1) 之化合物，其係具有式 (I-9) 之化合物，其中：

R_2 係-CH₂CF₂CF₃或-CH₂CF₃；

Q係選自由以下組成之群組的基團：式Qa1和Qb1，其中

A係N；並且

Q₁係氫、氯、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、2-吡啶基氧基、3-氯-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基、三唑-1-基或三唑-2-基。

【0121】 根據此實施方式的一組進一步傑出的化合物係具有式 (I-9h-2) 之化合物，其係具有式 (I-9) 之化合物，其中：

R_2 係-CH₂CF₂CF₃或-CH₂CF₃；

Q係選自由以下組成之群組的基團：式Qa1和Qb1，其中

A係N；並且

Q₁係氫、氯、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、2-吡啶基氧基、3-氯-吡啶-1-基或1,2,4-三唑-1-基。

【0122】 根據此實施方式的一組進一步傑出的化合物係具有式 (I-9i) 之化合物，其係具有式 (I-9) 之化合物，其中

R₂係-CH₂CF₂CHF₂或-CH₂CF₂CF₃；

Q係選自由以下組成之群組的基團：式Qa1和Qb1，其中

A係N；並且

Q₁係氫、氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N(CH₃)CO(環丙基)、-N(H)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CONH(CH₃)、(嘔啶-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘓啶-2-基（當Q係Qa1時）；或

Q₁係氫、氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N(CH₃)CO(環丙基)、-N(H)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CONH(CH₃)、(嘔啶-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘓啶-2-基（當Q係Qb1時）。

【0123】 根據此實施方式的一組進一步傑出的化合物係具有式 (I-9j) 之化合物，其係具有式 (I-9) 之化合物，其中

R₂係-CH₂CF₂CF₃或-CH₂CF₃；

Q係基團Qa1，其中

A係N；並且

Q₁係氫、氯、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、-NH(CH₃)、-

$N(CH_3)COCH_3$ 、2-吡啶基氧基、3-氯-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基、三唑-1-基或三唑-2-基。

【0124】 根據此實施方式的一組進一步傑出的化合物係具有式 (I-9j-1) 之化合物，其係具有式 (I-9j) 之化合物，其中

Q_1 係氫、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2-吡啶基氧基或3-氯-吡啶-1-基。

【0125】 根據此實施方式的一組進一步傑出的化合物係具有式 (I-9k) 之化合物，其係具有式 (I-9) 之化合物，其中

R_2 係 $-CH_2CF_2CF_3$ 或 $-CH_2CF_3$ ；

Q係基團Qb1，其中

A係N；並且

Q_1 係氫、氯、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2-吡啶基氧基、3-氯-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基、三唑-1-基或三唑-2-基。

【0126】 根據此實施方式的一組進一步傑出的化合物係具有式 (I-9k-1) 之化合物，其係具有式 (I-9k) 之化合物，其中

Q_1 係氫、氯、環丙基、1,2,4-三唑-1-基、三唑-1-基或三唑-2-基。

【0127】 根據此實施方式的一組進一步傑出的化合物係具有式 (I-9k-2) 之化合物，其係具有式 (I-9k) 之化合物，其中

Q_1 係氫、氯、環丙基或1,2,4-三唑-1-基。

【0128】 根據本發明的化合物可以具有任何數量的益處，尤其包括對於保護植物抵抗昆蟲的有利水平的生物活性或對於用作農用化學品活性成分的優越特性（例如，更高的生物活性、有利的活性譜、增加的安全性、改進的物理-化學特性、或增加的生物可降解性或環境特徵曲線）。具體而言，已經出人意料地

發現某些具有式 (I) 之化合物對於非靶標節肢動物特別是傳粉者 (如蜜蜂、獨居蜂和熊蜂) 可以顯示出有利的安全性。最特別地，對於義大利蜂 (*Apis mellifera*)。

【0129】 在另一方面，本發明提供了一種組成物，其包含殺昆蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物有效量的如在具有式 (I-1)、(I-2)、(I-3)、(I-4)、(I-5)、(I-6)、(I-7)、(I-8) 和 (I-9) (上文) 的化合物下的實施方式中任一項所定義的具有式 (I) 之化合物、或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，以及視需要，助劑或稀釋劑。

【0130】 在另一方面，本發明提供了一種對抗並控制昆蟲、蟎、線蟲或軟體動物之方法，該方法包括向有害生物、有害生物的場所或易受有害生物攻擊的植物施用殺昆蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物有效量的如在具有式 (I-1)、(I-2)、(I-3)、(I-4)、(I-5)、(I-6)、(I-7)、(I-8) 和 (I-9) (上文) 的化合物下的實施方式中任一項所定義的具有式 (I) 之化合物、或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，或如以上所定義的組成物。

【0131】 在又另一方面，本發明提供一種用於保護植物繁殖材料免受昆蟲、蟎、線蟲或軟體動物攻擊之方法，該方法包括用如上文所定義的組成物處理該繁殖材料或該繁殖材料所種植的場地。

【圖式簡單說明】

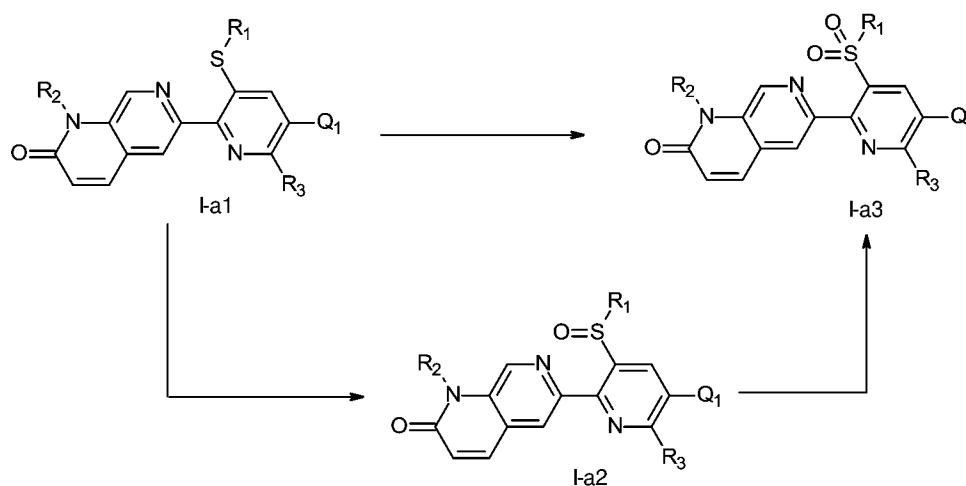
【0132】 無

【實施方式】

【0133】 根據本發明的用於製備具有式I之化合物之方法原則上藉由熟悉該項技術者已知之方法進行。更具體地，並且如流程1和2中所描述的，具有式I之化合物的子組 (其中X係SO (亞磺) 和/或SO₂ (磺)) 可以借助對應的具有式

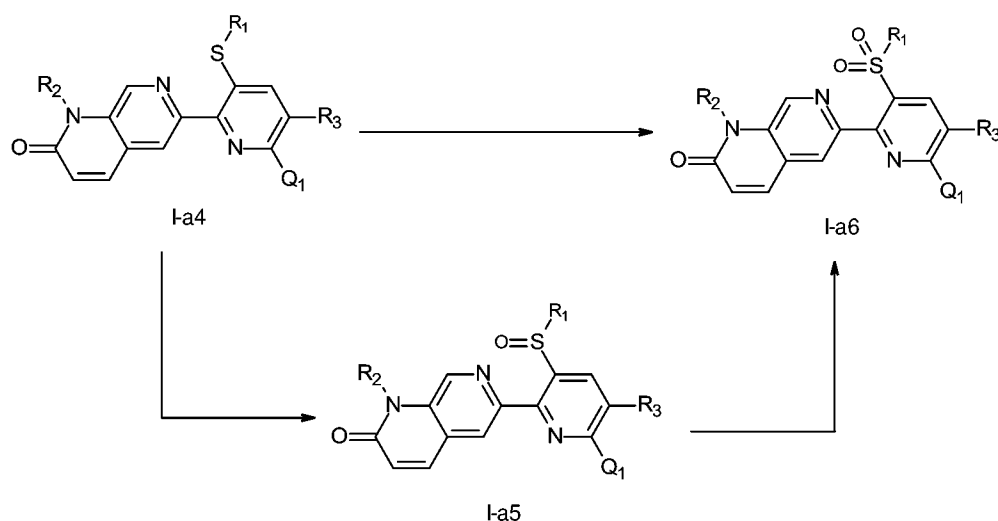
I之硫化物（其中X係S）的氧化反應來獲得，該氧化反應涉及試劑例如像間氯過氧苯甲酸（mCPBA）、過氧化氫、過硫酸氫鉀（oxone）、過碘酸鈉、次氯酸鈉或次氯酸三級丁酯（除其他氧化劑之外）。該氧化反應通常是在溶劑的存在下進行的。待用於該反應的溶劑的實例包括脂族鹵代烴，如二氯甲烷和氯仿；醇，如甲醇和乙醇；乙酸；水；及其混合物。待用於該反應的氧化劑的量通常是1至3莫耳，較佳的是係1至1.2莫耳（相對於用於產生亞磺化合物I的1莫耳的硫化物I），並且較佳的是係2至2.2莫耳的氧化劑（相對於用於產生磺化合物I的1莫耳的硫化物I）。此類氧化反應例如揭露於WO 2013/018928中。

流程1



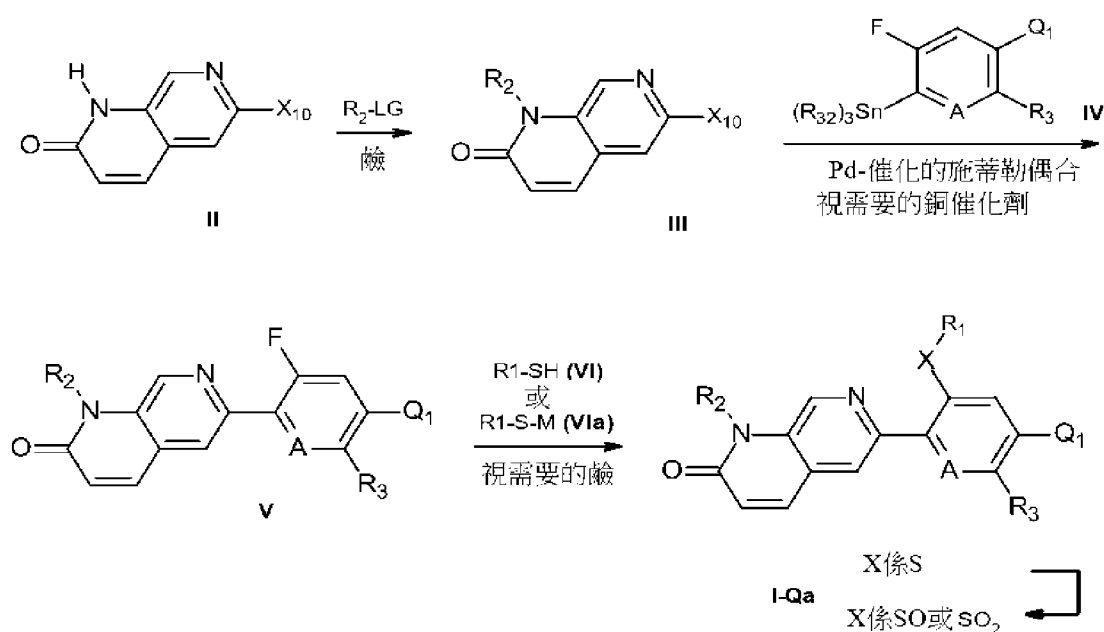
【0134】 先前在流程1中所述之由具有式I-a1的化合物得到具有式I-a2和I-a3的化合物的化學過程可以類似地應用於（流程2）由具有式I-a4的化合物製備具有式I-a5和I-a6的化合物，其中先前提到的所有取代基定義仍然有效。

流程2



【0135】 具有式I之化合物的子組（其中 R_2 係如在式I中定義的並且其中Q被定義為 Q_a ，其中A、 Q_1 、 R_3 、X和 R_1 係如式I中定義的）可以被定義為具有式I- Q_a 的化合物（流程3）。

流程3



【0136】 具有式I- Q_a 的化合物（其中X係S，並且其中A、 R_1 、 R_2 、 Q_1 、和 R_3 係如在式I中定義的）可以藉由使以下項反應製備：具有式V的化合物（其中 R_2 、 Q_1 、A和 R_3 係如在式I中定義的）與具有式VI的試劑

R_1 -SH (VI)，

或其鹽（其中 R_1 係如在式I中定義的），視需要在合適的鹼（如鹼金屬碳酸鹽

例如碳酸鈉和碳酸鉀，或鹼金屬氫化物如氫化鈉，或鹼金屬氫氧化物如氫氧化鈉和氫氧化鉀，或三級丁醇鈉或三級丁醇鉀)的存在下，在惰性溶劑中，在較佳的是25°C-120°C之間的溫度下。待使用的溶劑的實例包括醚，如四氫呋喃THF、乙二醇二甲醚、三級丁基甲基醚和1,4-二噁咁；芳香烴，如甲苯和二甲苯；腈，如乙腈；或極性非質子溶劑，如N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基-2-吡咯啉酮NMP或二甲亞砷。具有式VI的化合物的鹽的實例包括具有式VIa的化合物



其中R₁係如上文定義的並且其中M例如是鈉或鉀。由具有式V的化合物製備具有式I-Qa的化合物的此種方法可以例如在WO 16/091731中找到。

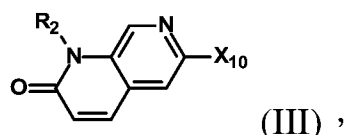
【0137】 可替代地，形成I-Qa的此反應可以在鈀催化劑(如三(二亞苺基丙酮)二鈀(0))的存在下在膦配位基(如xanthphos)的存在下，在惰性溶劑(例如，二甲苯)中，在100°C-160°C之間的溫度(較佳的是140°C)下進行，如在Tetrahedron [四面體] 2005, 61, 5253-5259中描述的。

【0138】 具有式V的化合物(其中R₂、Q₁、A和R₃係如式I中定義的)可以藉由具有式IV化合物(其中Q₁、A和R₃係如以上式I中定義的，並且其中R₃₂係C₁-C₁₀烷基，較佳的是正丁基或甲基)與具有式III的化合物(其中R₂係如以上式I中定義的，並且其中X₁₀係脫離基，像例如氯、溴或碘(較佳的是氯或溴)，或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯，如三氟甲磺酸酯)之間的施蒂勒(Stille)反應製備。此類施蒂勒反應通常是在鈀催化劑(例如四(三苺基膦)鈀(0)、乙酸鈀(II)或雙(三苺基膦)二氯化鈀(II))的存在下，並且在配位基(如膦配位基xanthphos、xphos，除其他外)的存在下，在惰性溶劑(如N,N-二甲基甲醯胺、乙腈、甲苯或二噁咁)中，視需要在添加劑(如氟化銻或氯化鋰)的存在下，並且視需要在另外的催化劑(例如碘化銅(I))的存在下進行。此類施蒂勒偶合也是熟悉該項技術者眾所周知的，

並且已經描述於例如J. Org. Chem.[有機化學雜誌]，2005，70，8601-8604，J. Org. Chem.[有機化學雜誌]，2009，74，5599-5602，以及Angew. Chem. Int. Ed.[應用化學國際版本]，2004，43，1132-1136中。

【0139】 具有式III的化合物（其中 R_2 係如以上式I中定義的，並且其中 X_{10} 係脫離基，像例如氯、溴或碘（較佳的是氯或溴），或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯，如三氟甲磺酸酯，係如式I中定義的，並且其中 X_{10} 係鹵素（或擬鹵素脫離基，如三氟甲磺酸酯），較佳的是溴或氯）可以藉由使具有式II的化合物（其中 X_{10} 係鹵素（或擬鹵素脫離基，如三氟甲磺酸酯））與具有式 R_2 -LG的試劑（其中 R_2 係如式I中定義的，並且其中LG為鹵素，較佳的是為碘、溴或氯（或擬鹵素脫離基，如（鹵）烷基或苯基磺酸酯，例如三氟甲磺酸酯））在鹼（如氫化鈉或鹼土金屬氫化物、碳酸鹽（例如碳酸鈉、碳酸鉀或碳酸銻）或氫氧化物）的存在下，在惰性溶劑（如四氫呋喃、二噁咁，N,N-二甲基甲醯胺DMF、N,N-二甲基乙醯胺或乙腈等）中，在 0°C 與 120°C 之間的溫度下，藉由熟悉該項技術者眾所周知的程序進行反應來製備。

【0140】 此類具有式III的化合物



其中

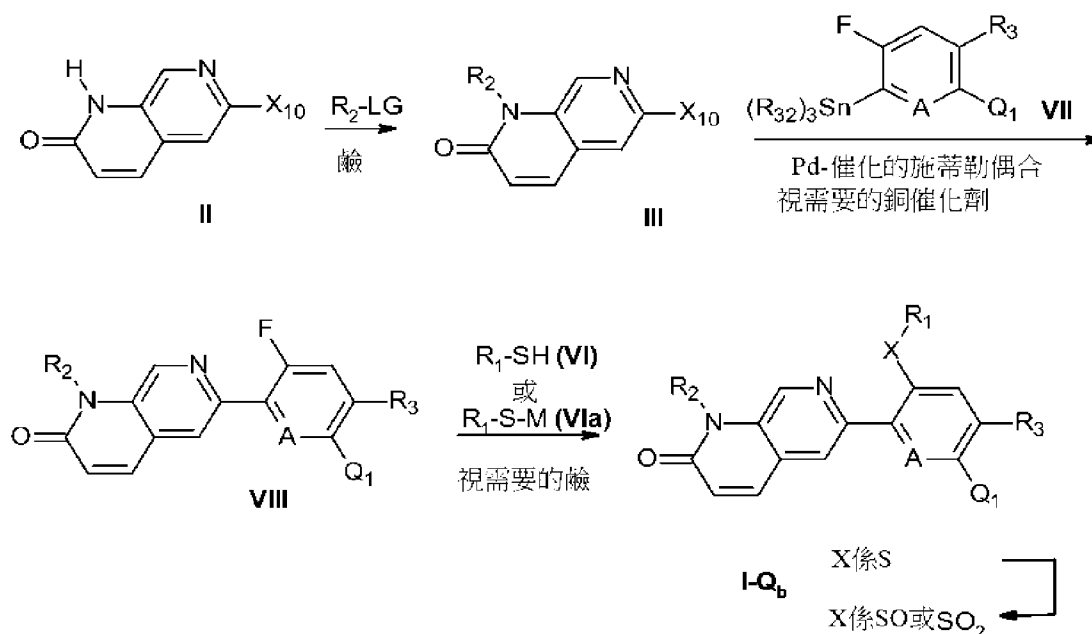
R_2 係如式I中定義的；並且

X_{10} 係鹵素或擬鹵素脫離基，如三氟甲磺酸酯，

係新穎的，係為了製備根據本發明的具有式I之化合物而尤其開發的並且因此表示本發明的另一目的。具有式I之化合物的取代基的優先選項和較佳的實施方式對具有式III的化合物也是有效的。較佳的是， X_{10} 係溴或氯；甚至更較佳的是， X_{10} 係溴。

【0141】 先前在流程3中所述之由具有式II的化合物得到具有式I-Qa的化合物的化學過程可以類似地應用於(流程4)由具有式II的化合物製備具有式I-Qb的化合物，其中先前提到的所有取代基定義仍然有效。

流程4：



【0142】 具有式VI的化合物(其中R₁係如式I中定義的)以及具有式VIa的化合物(其中R₁係如上文定義的並且其中M係例如鈉或鉀)係已知的、可商購的或可以藉由熟悉該項技術者已知之方法來製備。

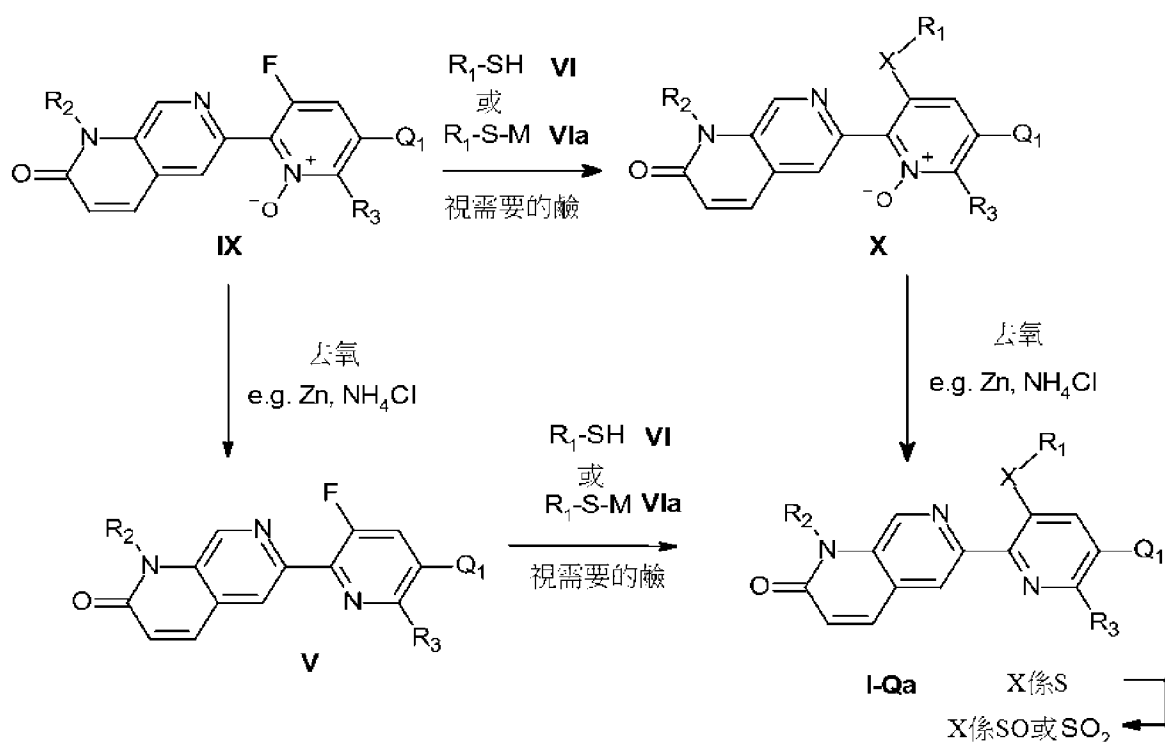
具有式IV的化合物和具有式VII的化合物(其中Q₁、A和R₃係如以上式I中定義的，並且其中R₃₂係C₁-C₁₀烷基，較佳的是正丁基或甲基)；以及

具有式R₂-LG的試劑(其中R₂係如式I中定義的並且其中LG係鹵素，較佳的是碘、溴或氯(或擬鹵素脫離基，如(鹵)烷基或苯基磺酸酯，例如三氟甲磺酸酯)；

係已知的、可商購的或者可以藉由熟悉該項技術者已知之方法來製備。

【0143】 可替代地，具有式I-Qa的化合物(其中R₁、R₂、R₃、Q₁和X係如以上式I中定義的並且其中A係N)可以按照流程5來製備。

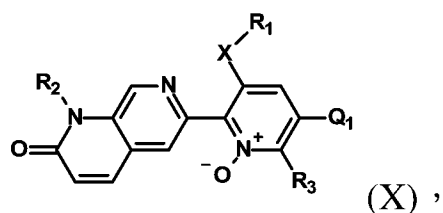
流程5：



【0144】 具有式I-Qa的化合物（其中X係S，並且其中R₁、R₂、R₃、和Q₁係如以上式I中定義的）藉由使用試劑如鋅粉和氯化銨，較佳的是飽和氯化銨水溶液，在醚溶劑如四氫呋喃或二噁咻中，在0°C與回流條件之間的溫度下使具有式X的化合物（其中X係S，並且其中R₁、R₂、Q₁和R₃係如式I中定義的）去氧來製備（流程5）。可替代地，此種還原也可以在熟悉該項技術者已知的條件下實現，例如藉由在乙酸中包含鐵粉，或者使用分子氫（H₂），視需要在壓力下，通常在催化劑（例如像雷氏鎳）存在下，或使用轉移氫化條件（例如，室溫附近在四氫呋喃中的甲酸銨和5%-10%鈹炭），或使用雙(醌合(pinacolato))二硼（4,4,5,5-四甲基-2-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜環戊硼烷-2-基)-1,3,2-二氧雜環戊硼烷）或使用磷基試劑，如三氯化磷、亞磷酸三乙酯或三苯基磷。

【0145】 具有式X的化合物（其中X係S，並且其中R₁、R₂、Q₁和R₃係如式I中定義的）可以由具有式IX的化合物（其中R₂、R₃和Q₁係如以上式I中所述之）藉由如流程3中所述之用於由具有式V的化合物製備具有式I-Qa的化合物的類似程序製備。

【0146】 此類具有式X的化合物



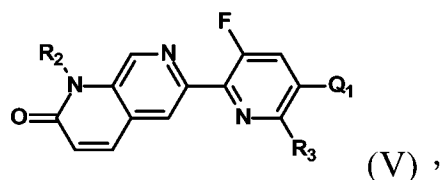
其中

X係S，並且其中R₂、Q₁、R₃和R₁係如式I中定義的，

係新穎的，係為了製備根據本發明的具有式I之化合物而尤其開發的並且因此表示本發明的另一目的。具有式I之化合物的取代基的優先選項和較佳的實施方式對具有式X的化合物也是有效的。

【0147】 可替代地，具有式I-Qa的化合物（其中X係S）可以由具有式IX的化合物藉由涉及與上文描述的相同的化學過程，但藉由改變該等步驟的順序（即，藉由進行順序IX至V（經由去氧/還原），隨後是V與VI或VIa的反應以形成I-Qa，其中先前提到的所有取代基定義仍然有效）製備。

【0148】 具有式V的化合物



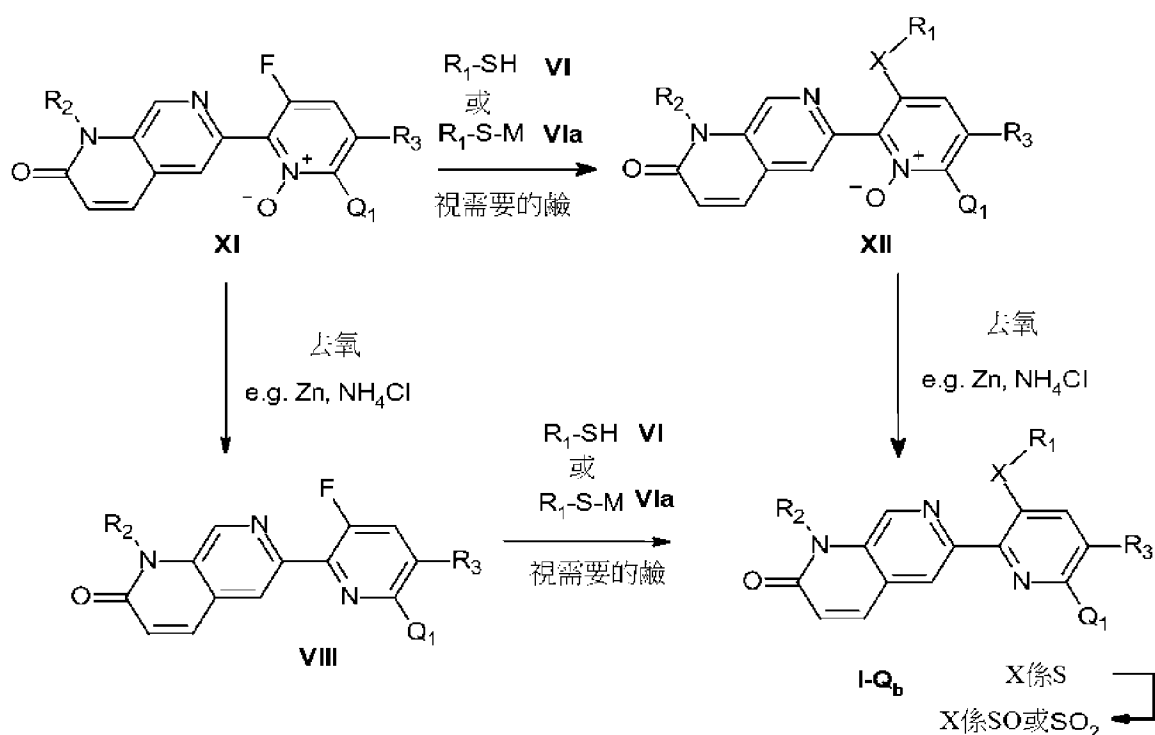
其中

R₂、Q₁和R₃係如在式I中定義的，

係新穎的，係為了製備根據本發明的具有式I之化合物而尤其開發的並且因此表示本發明的另一目的。具有式I之化合物的取代基的優先選項和較佳的實施方式對具有式V的化合物也是有效的。

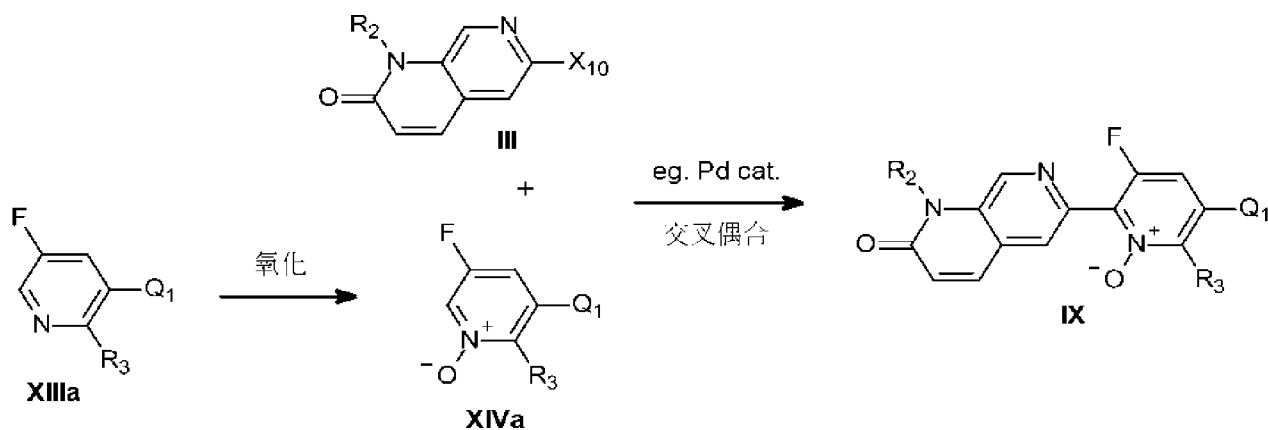
【0149】 先前在流程5中所述之由具有式IX的化合物得到具有式I-Qa的化合物的化學過程可以類似地應用於（流程6）由具有式XI的化合物製備具有式I-Qb的化合物，其中先前提到的所有取代基定義仍然有效。

流程6：



【0150】 具有式IX的化合物（其中 R_2 、 Q_1 和 R_3 係如在式I中定義的）

流程7：

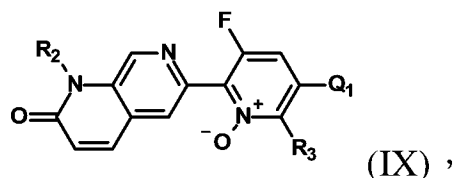


【0151】 可以藉由在金屬催化（較佳的是鈀催化）條件下，例如涉及[1,1' 雙(二苯基膦基)二茂鐵]二氯化鈀 ($\text{PdCl}_2(\text{dppf})$)（視需要作為與二氯甲烷的錯合物（較佳的是1:1錯合物）），在鹼如2,2,6,6-四甲基哌啶氯化鋅氯化鋰（2,2,6,6-tetramethylpiperidide zinc chloride lithium chloride）（ $\text{TMPZnCl}\cdot\text{LiCl}$ ；商業的或根據Org. Lett. [有機快報] 2009, 11, 1837-1840製備的）（較佳的是以在四氫呋喃中的四甲基哌啶基氯化鋅氯化鋰錯合物的溶液形式）存在下，在醚溶劑如四氫呋喃、

二噁唑或1,2-二甲氧基乙烷(較佳的是四氫呋喃)中,在0°C與回流條件之間(較佳的是在室溫與80°C之間)的溫度下,較佳的是在惰性氣氛下,並且視需要微波輻射下具有式III的化合物(其中R₂係如以上式I中定義的,並且其中X₁₀係鹵素(或擬鹵素脫離基,例如三氟甲磺酸酯),較佳的是溴或氯)與具有式XIVa的化合物(其中Q₁和R₃係如式I中定義的)之間的交叉偶合反應製備(流程7)。此類交叉偶合條件已經描述於例如有機快報2012, 14, 862-865中。

【0152】 可替代地,此交叉偶合步驟也可以在Fagnou型條件(由Fagnou等人描述於例如有機快報2011, 13, 2310-13和J. Am. Chem. Soc. [美國化學會誌] 2009, 131, 3291-3306)(包括乙酸鈹和磷配位基如三三級丁基磷四氟硼酸鹽(PtBu₃-HBF₄))下,在鹼如碳酸鉀或碳酸鈉存在下,在溶劑如四氫呋喃、二噁唑、乙腈、N,N-二甲基甲醯胺或甲苯中,在0°C與150°C之間(較佳的是在室溫與120°C之間)的溫度下,較佳的是在惰性氣氛下,並且視需要微波輻射下進行。

【0153】 此類具有式IX的化合物



其中

R₂、Q₁和R₃係如在式I中定義的,

係新穎的,係為了製備根據本發明的具有式I之化合物而尤其開發的並且因此表示本發明的另一目的。具有式I之化合物的取代基的優先選項和較佳的實施方式對具有式IX的化合物也是有效的。

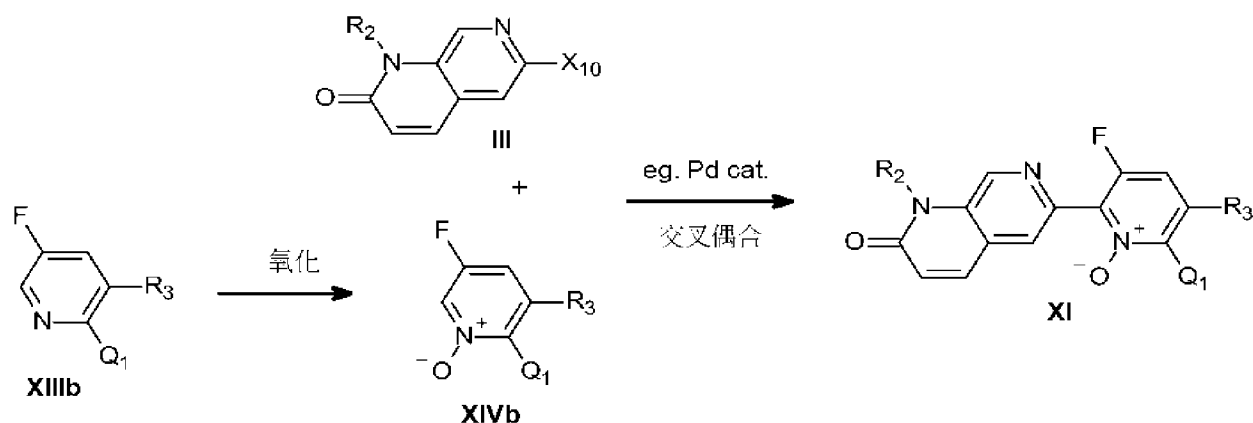
【0154】 具有式XIVa的化合物(其中Q₁和R₃係如式I中定義的)可以在熟悉該項技術者已知的條件(涉及例如間氯過苯甲酸)下,在惰性溶劑如乙酸乙酯、氯仿或二氯甲烷中,在0°C與80°C之間、較佳的是10°C至70°C的溫度下,藉由氧化具有式XIIIa的化合物(其中Q₁和R₃係如式I中定義的)來製備。可替代地,可

以使用其他合適的氧化劑，例如像甲基三氧錒和過氧化氫（含水或作為脲錯合物），乙酸中的過氧化氫，或在酸酐（例如三氟乙酸酐）存在下的 H_2O_2 /脲加合物。此類氧化從文獻，例如從J. Med. Chem.[藥物化學雜誌] 1989, 32, 2561、WO 00/15615或WO 20/182577已知。

【0155】 具有式XIIIa的化合物（其中 Q_1 和 R_3 係如式I中定義的）係已知的、可商購的或可藉由熟悉該項技術者已知之方法製備或藉由與例如在WO 20/182577中找到的說明類似地製備。

【0156】 先前在流程7中所述之得到具有式IX的化合物的化學過程可以類似地應用於（流程8）製備具有式XI的化合物，其中先前提到的所有取代基定義仍然有效。

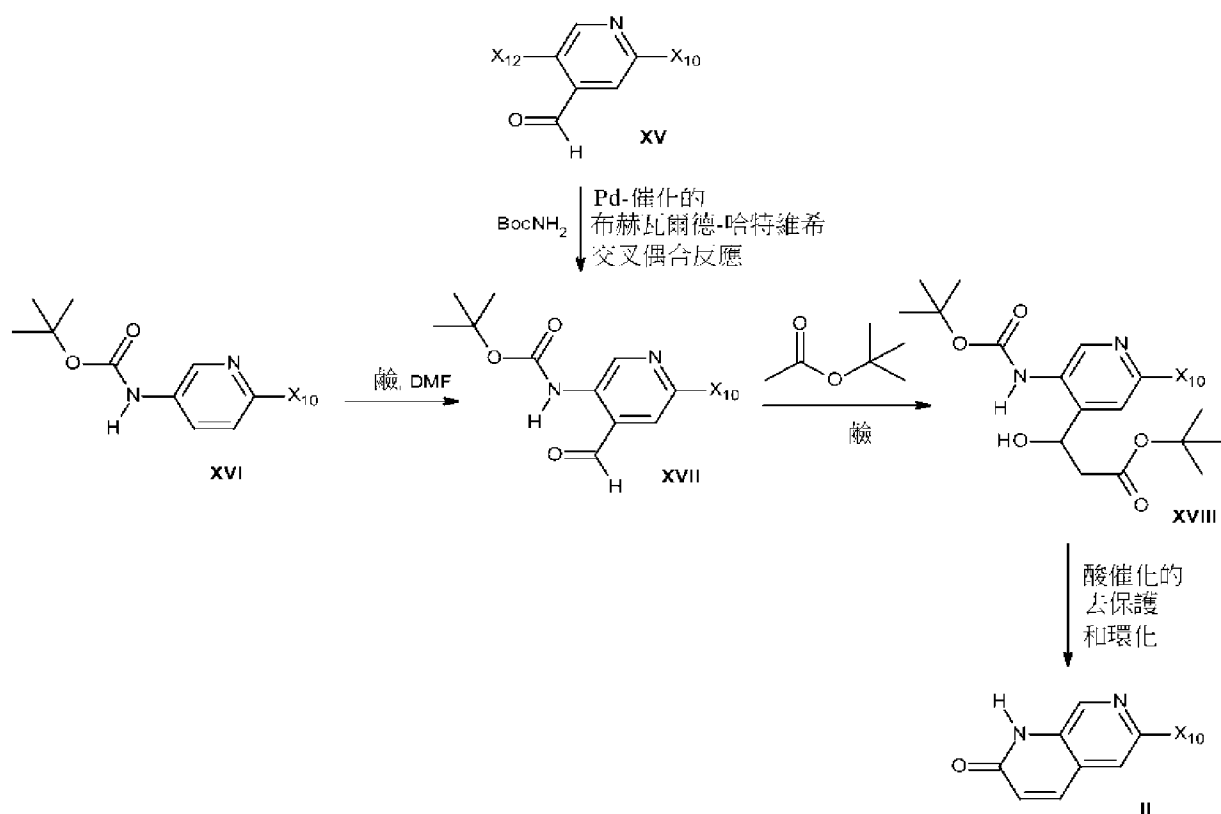
流程8：



【0157】 具有式XIIIb的化合物（其中 Q_1 和 R_3 係如式I中定義的）係已知的、可商購的或可藉由熟悉該項技術者已知之方法製備。

【0158】 具有式II的化合物可以按照流程9製備。

流程9：

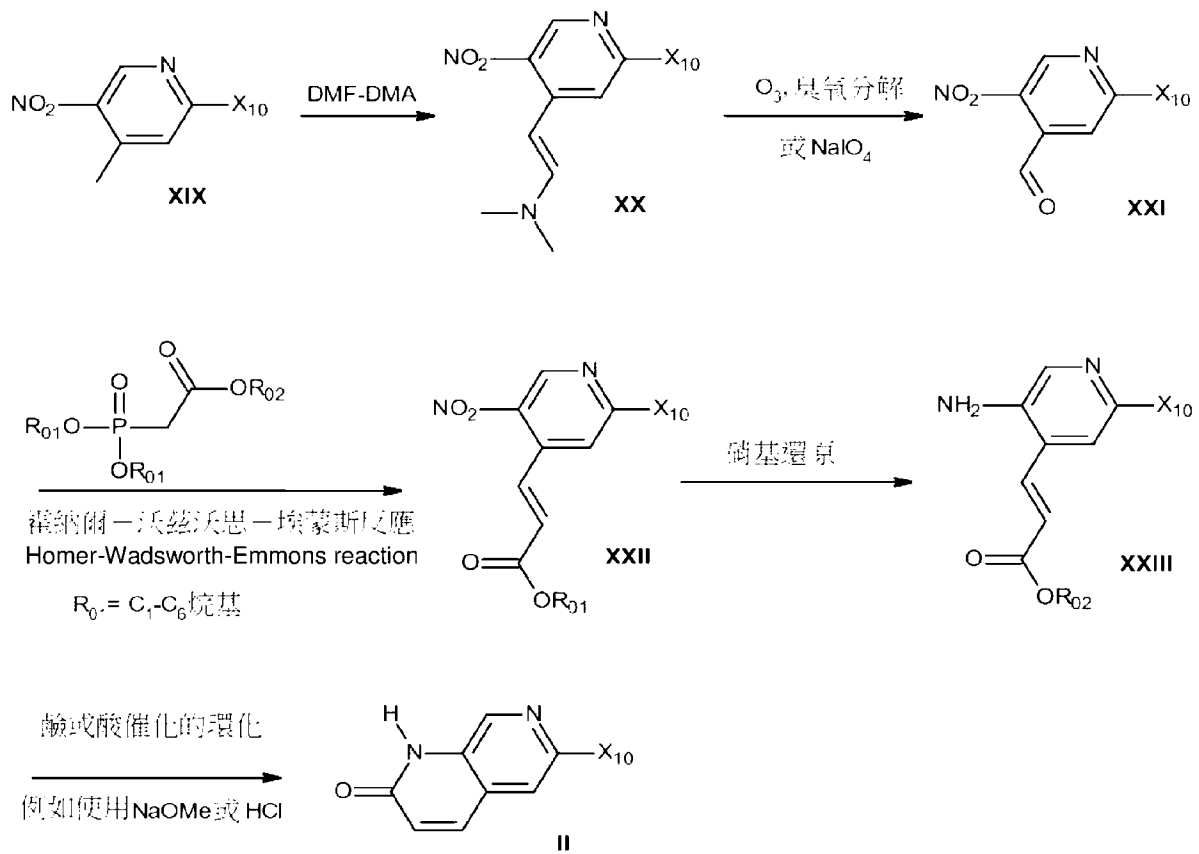


【0159】 具有式II的化合物（其中X₁₀係鹵素（或擬鹵素脫離基，如三氟甲磺酸酯），較佳的是溴或氯）可以藉由BOC-官能基（三級丁氧基羰基）的酸催化去保護和隨後的胺和羧酸分子內環化形成羧醯胺來製備（流程9）。這樣的反應可以在酸如三氟乙酸、鹽酸、硫酸（除其他外）的存在下，並且視需要在溶劑如鹵代溶劑像二氯甲烷、二氯乙烷、水（除其他外）存在下並且在室溫與溶劑或試劑的沸點之間的溫度下進行。具有式XVIII的化合物（其中X₁₀係鹵素（或擬鹵素脫離基，如三氟甲磺酸酯），較佳的是溴或氯）可以藉由具有式XVII的化合物（其中X₁₀係鹵素（或擬鹵素脫離基，如三氟甲磺酸酯），較佳的是溴或氯）與乙酸三級丁酯在合適的鹼（如n-BuLi、二異丙基胺基鋰、Li-TMP（除其他外））存在下並且在溶劑如四氫呋喃、二噁咻、二甲基甲醯胺（除其他外）的存在下並且在-78°C與溶劑沸點之間的溫度下的反應製備。具有式XVII的化合物（其中X₁₀係鹵素（或擬鹵素脫離基，如三氟甲磺酸酯），較佳的是溴或氯）可以藉由具有式XVI的化合物（其中X₁₀係鹵素（或擬鹵素脫離基，如三氟甲磺酸酯），較佳的是溴或氯）使用鹼（如n-BuLi、二異丙基胺基鋰、Li-TMP）的金屬化以及隨後與DMF

在溶劑如四氫呋喃、二噁咁、二甲基甲醯胺的存在下反應製備。此類反應例如在 *J. Org. Chem.* [有機化學雜誌] 1990, 55, 4744 中已知。可替代地，具有式XVII的化合物可以藉由具有式XV的化合物（其中X₁₀和X₁₂獨立地是鹵素（或擬鹵素脫離基，如三氟甲磺酸酯），較佳的是溴或氯）與胺基甲酸三級丁酯（BOCNH₂）之間的鈀催化的選擇性布赫瓦爾德-哈特維希（Buchwald-Hartwig）交叉偶合反應來製備。這樣的反應可以在金屬催化劑（較佳的是鈀催化劑）如[1,1'雙(二苯基膦基)二茂鐵]二氯化鈀（PdCl₂(dppf)）或Pd(OAc)₂存在下並且在配位基（如三丁基膦、dppf、Xantphos、Xphos）的存在下並在鹼（如三級丁醇鈉、碳酸鉀、碳酸鈹、碳酸鈉）的存在下，並且在溶劑（如四氫呋喃、二噁咁或1,2-二甲氧基乙烷、甲苯）的存在下，並且在0°C與回流條件之間的溫度下，較佳的是在惰性氣氛下，以及視需要在微波輻射下進行。這樣的反應在文獻中是眾所周知的，並且例如描述於 *Chem. Rev.* [化學綜述] 2016, 116, 19, 12564-12649 和 *J. Org. Chem.* [有機化學雜誌] 1999, 64, 15, 5575-5580 中。

【0160】 可替代地，具有式II的化合物（其中X₁₀係鹵素（或擬鹵素脫離基，例如三氟甲磺酸酯），較佳的是溴或氯）

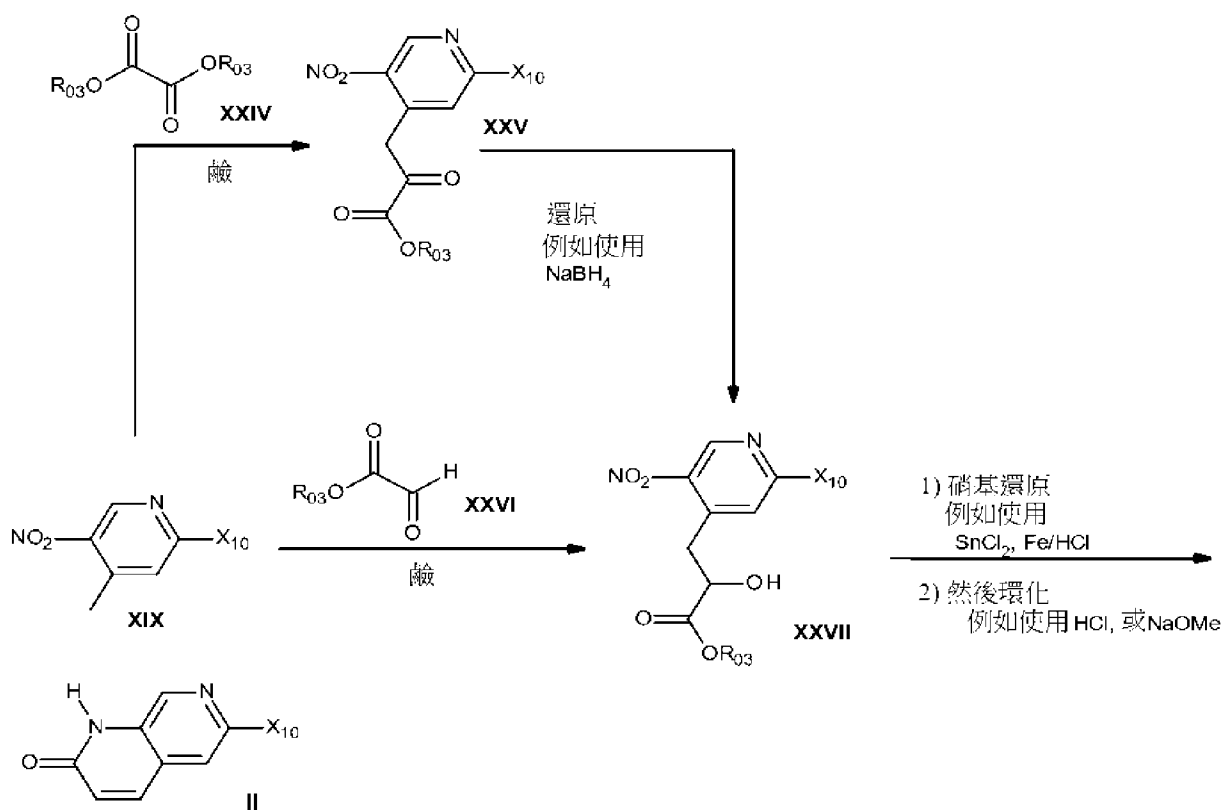
流程10：



【0161】 可以按照流程10並類似於如WO 2000/049015中描述的程序來製備。

【0162】 可替代地，具有式II的化合物(其中X₁₀係鹵素(或擬鹵素脫離基，例如三氟甲磺酸酯)，較佳的是溴或氯)

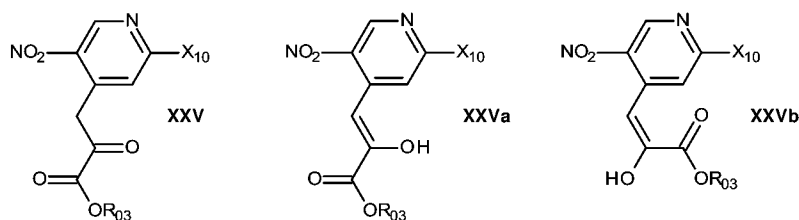
流程11：



【0163】 可以由具有式XXVII的化合物（其中X₁₀係鹵素（或擬鹵素脫離基，例如三氟甲磺酸酯），較佳的是溴或氯，並且其中R₀₃係C₁-C₆烷基、苄基或芳基）在酸催化劑如乙酸、鹽酸HCl、硫酸H₂SO₄或三氟乙酸TFA的存在下，或在鹼如甲醇鈉的存在下，經由硝基還原和隨後的分子內環化製備（流程11）。

【0164】 硝基還原典型地在氯化銨、Sn/HCl或四氫基二硼（除其他外）的存在下並且在0°C至反應混合物沸點之間的溫度下使用試劑如鐵。這樣的反應在文獻中是已知的，並且例如描述於例如Synthesis [合成], 2018, 50, 1765-1768, Org. Lett. [有機快報] 2014, 16, 19, 5192-5195, Organic Letters [有機快報] (2019), 21(9), 3465-3469和Synthetic Communications [合成通訊], 2007, 37, 2777-2786中。

【0165】 具有式XXV的化合物可能以不同的互變異構形式存在，如XXVa和/或XXVb：



【0166】 本發明覆蓋所有比例的所有此類異構物和互變異構物及其混合物。

【0167】 具有式XXVII的化合物(其中X₁₀係鹵素(或擬鹵素脫離基,如三氟甲磺酸酯),較佳的是溴或氯,並且其中R₀₃係C₁-C₆烷基、苄基或芳基)可以藉由以下方式製備:在鹼(如三級丁醇鉀、甲醇鈉、乙醇鈉、氫化鈉、正丁基鋰、1,8-二氮雜雙環(5.4.0)十一碳-7-烯(DBU)、二異丙基胺基鋰,除其他類似的鹼外)的存在下,視需要在溶劑如四氫呋喃、甲醇、二噁咁、乙醇、DMF的存在下,並且在-78°C至反應混合物的沸點之間的溫度下使具有式XIX的化合物(其中X₁₀係鹵素(或擬鹵素脫離基,如三氟甲磺酸酯),較佳的是溴或氯)與具有式XXVI的化合物(其中R₀₃係C₁-C₆烷基、苄基或芳基)進行反應。

【0168】 可替代地,具有式XXVII的化合物(其中X₁₀係鹵素(或擬鹵素脫離基,如三氟甲磺酸酯),較佳的是溴或氯,並且其中R₀₃係C₁-C₆烷基、苄基或芳基)可以由具有式XIX的化合物以兩個步驟製備。第一步驟涉及在鹼(如三級丁醇鉀、甲醇鈉、乙醇鈉、氫化鈉、正丁基鋰、1,8-二氮雜雙環(5.4.0)十一碳-7-烯(DBU)、二異丙基胺基鋰,除其他類似的鹼外)的存在下,視需要在溶劑如四氫呋喃、甲醇、二噁咁、乙醇、DMF的存在下,並且在-78°C至反應混合物的沸點之間的溫度下使具有式XIX的化合物與具有式XXIV的化合物(其中R₀₃係C₁-C₆烷基、苄基或芳基)進行反應。並且第二步驟涉及在還原劑(如硼基還原劑,例如硼氫化鈉、硼烷,或鋁基試劑,例如二異丁基氫化鋁或氫化鋁鋰)的存在下的具有式XXV化合物(其中X₁₀係鹵素(或擬鹵素脫離基,如三氟甲磺酸酯),較佳的是溴或氯,並且其中R₀₃係C₁-C₆烷基、苄基或芳基)的羰基還原。這樣的兩步

驟程序在文獻中是已知的，例如，如描述於WO2005/044802中。

【0169】 具有式XV的化合物(其中X₁₀和X₁₂獨立地是鹵素(或擬鹵素脫離基，如三氟甲磺酸酯)，較佳的是溴或氯)；以及

具有式XVI的化合物(其中X₁₀係鹵素(或擬鹵素脫離基，例如三氟甲磺酸酯)，較佳的是溴或氯)；以及

具有式XIX的化合物(其中X₁₀係鹵素(或擬鹵素脫離基，例如三氟甲磺酸酯)，較佳的是溴或氯)；以及

具有式XXIV和XXVI的化合物(其中R₀₃係C₁-C₆烷基、苄基或芳基)；

係已知的、可商購的或者可以藉由熟悉該項技術者已知之方法來製備。

【0170】 可替代地，具有式I-Qb的化合物還可以按照流程12製備。在特定情況中，當Q₁為經由氮原子連接至含有基團A的環的視需要取代的三唑時，則具有式I-Qb的化合物(其中X係S並且其中R₁、R₂、Q₁和R₃係如式I中定義的)

流程12：

需要在微波輻射下反應（C-N鍵形成）來製備（流程12）。

【0172】 在流程12內的特定情況中，當 Q_1 為 $-N(R_4)COR_5$ 或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ （其中 R_4 和 R_5 係如式I中定義的）時，則具有式I-Qb的化合物（其中X係S）可以由具有式XXXIb的化合物（其中X係S並且其中 R_1 、 R_2 和 R_3 係如式I中定義的，並且其中 X_{11} 係脫離基，像例如氯、溴或碘（較佳的是氯或溴），或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯（如三氟甲磺酸酯））藉由與試劑 Q_1-H (XVIIIaa)（相當於 $HN(R_4)COR_5$ 或 $HN(R_4)CON(R_4)_2$ ，其中 R_4 和 R_5 係如式I中定義的）反應（C-N鍵形成）來製備。這種反應係在鹼（如碳酸鉀、碳酸鈉、氫氧化鈉）的存在下，在惰性溶劑（如甲苯、二甲基甲醯胺DMF、N-甲基吡咯啉NMP、二甲亞砜DMSO、二噁啉、四氫呋喃THF等）中，視需要在催化劑（例如乙酸鈣(II)、雙(二亞苄基丙酮)鈣(0)（ $Pd(dba)_2$ ）或三(二亞苄基丙酮)二鈣(0)（ $Pd_2(dba)_3$ ），視需要呈氯仿加合物的形式）或鈣預催化劑（例如像*tert*-BuBrettPhos Pd G3 [(2-二-三級丁基膦基-3,6-二甲氧基-2',4',6'-三異丙基-1,1'-聯苯)-2-(2'-胺基-1,1'-聯苯)]甲磺酸鈣(II)或BrettPhos Pd G3 [(2-二-環己基膦基-3,6-二甲氧基-2',4',6'-三異丙基-1,1'-聯苯)-2-(2'-胺基-1,1'-聯苯)]甲磺酸鈣(II)）的存在下，並且視需要在配位基（例如SPhos、*t*-BuBrettPhos或Xantphos）的存在下，在60°C-120°C之間的溫度下，視需要在微波輻射下進行。

【0173】 在流程12內的特定情況中，當 Q_1 係 $-N(R_4)_2$ （其中 R_4 係如式I中定義的）時，則具有式I-Qb的化合物（其中X係S）可以由具有式XXXIb的化合物（其中X係S並且其中 R_1 、 R_2 和 R_3 係如式I中定義的，並且其中 X_{11} 係脫離基，像例如氯、溴或碘（較佳的是氯或溴），或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯（如三氟甲磺酸酯））藉由與試劑 Q_1-H (XVIIIaa)（相當於 $HN(R_4)_2$ ，其中 R_4 係如式I中定義的），或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽、或三氟乙酸鹽、或任何其他等效鹽）反應（C-N鍵形成）來製備。這種反應通常是在惰性溶劑（如醇、醯胺、

酯、醚、腈和水，特別較佳的是甲醇、乙醇、2,2,2-三氟乙醇、丙醇、異丙醇、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、二噁吡、四氫呋喃、二甲氧基乙烷、乙腈、乙酸乙酯、甲苯、水或其混合物)中，在0°C-150°C之間的溫度下，視需要在微波輻射或使用高壓釜的加壓條件下，視需要在銅催化劑(如銅粉、碘化銅(I)或硫酸銅(視需要呈水合物的形式)或其混合物)的存在下，視需要在配位基(例如二胺配位基(例如N,N'-二甲基乙二胺或反式-環己基二胺)或二亞苺基丙酮(dba)或1,10-啡啉)的存在下，並且視需要在鹼(如磷酸鉀)的存在下進行。

【0174】 試劑 $\text{HN}(\text{R}_4)_2$ 、 $\text{HN}(\text{R}_4)\text{COR}_5$ 、或 $\text{HN}(\text{R}_4)\text{CON}(\text{R}_4)_2$ (其中 R_4 和 R_5 係如式I中定義的)係已知的、可商購的或可以藉由熟悉該項技術者已知之方法來製備。

【0175】 可替代地，具有式I-Qb的化合物(其中X係S)可以藉由鈴木(Suzuki)反應(流程12)來製備，該反應涉及例如使具有式XXXIb的化合物(其中X係S並且其中 R_1 、 R_2 和 R_3 係如式I中定義的，並且其中 X_{11} 係脫離基，像例如氯、溴或碘(較佳的是氯或溴)，或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯(如三氟甲磺酸酯))與具有式XVIII的化合物(其中 Q_1 係如式I中定義的，並且其中 Y_{b1} 可以是硼衍生的官能基，例如像 $\text{B}(\text{OH})_2$ 或 $\text{B}(\text{OR}_{b1})_2$ ，其中 R_{b1} 可以是 C_1 - C_4 烷基或兩個基團 OR_{b1} 可以與硼原子一起形成五員環，像例如醌(pinacol)硼酸酯)反應。該反應可以被鈰基催化劑(例如四(三苯基-膦)鈰(0)、(1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵)二氯-鈰-二氯甲烷(1:1錯合物)或氯(2-二環己基膦基-2',4',6'-三異丙基-1,1'-二苯基)[2-(2'-胺基-1,1'-二苯基)]鈰(II)(XPhos環鈰配合物))催化，在鹼(像碳酸鈉、磷酸三鉀或氟化銻)的存在下，在溶劑或溶劑混合物(像例如二噁吡、乙腈、N,N-二甲基甲醯胺、1,2-二甲氧基乙烷和水的混合物或二噁吡/水的混合物、或甲苯/水的混合物)中，較佳的是在惰性氣氛下。反應溫度可以優先地在從室溫至反應混合物的沸點的範圍內，或者該反應可以在微波輻射下進行。此類鈴木反應係熟悉該項技術者

眾所周知的，並且已經例如綜述於J.Orgmet. Chem. [有機金屬化學雜誌] 576, 1999, 147-168中。

【0176】 可替代地，具有式I-Qb的化合物（其中X係S）可以藉由具有式XVIIIa的化合物（其中Q₁係如上定義的，並且其中Y_{b2}係三烷基錫衍生物，較佳的是係三-正丁基錫或三甲基錫）與具有式XXXIb的化合物（其中X係S並且其中R₁、R₂和R₃係如式I中定義的，並且其中X₁₁係脫離基，像例如氯、溴或碘（較佳的是氯或溴），或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯（如三氟甲磺酸酯））之間的施蒂勒反應來製備。此類施蒂勒反應通常是在鈣催化劑（例如四(三苯基膦)鈣(0)或雙(三苯基膦)二氯化鈣(II)）的存在下，在惰性溶劑（如N,N-二甲基甲醯胺、乙腈、甲苯或二噁咻）中，視需要在添加劑（如氟化銫或氯化鋰）的存在下，並且視需要在另外的催化劑（例如碘化銅(I)）的存在下進行。此類施蒂勒偶合也是熟悉該項技術者眾所周知的，並且已經描述於例如J. Org. Chem.[有機化學雜誌]，2005，70，8601-8604，J. Org. Chem.[有機化學雜誌]，2009，74，5599-5602，以及Angew. Chem. Int. Ed.[應用化學國際版本]，2004，43，1132-1136中。

【0177】 當Q₁係五員芳香族環系統（經由氮原子連接至含有取代基A的環）時，則具有式I-Qb的化合物（其中X係S）可以由具有式XXXIb的化合物（其中X係S並且其中R₁、R₂和R₃係如式I中定義的，並且其中X₁₁係脫離基，像例如氯、溴或碘（較佳的是氯或溴），或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯（如三氟甲磺酸酯））藉由與雜環Q₁-H（其包含合適的NH官能度）(XVIIIaa)（其中Q₁如以上定義的），在鹼（如碳酸鉀K₂CO₃或碳酸銫Cs₂CO₃）的存在下，視需要在銅催化劑（例如碘化銅(I)）的存在下，在具有或不具有添加劑（如L-脯胺酸、N,N'-二甲基環己烷-1,2-二胺或N,N'-二甲基-乙二胺）的情況下，在惰性溶劑（如N-甲基吡咯啉酮NMP或N,N-二甲基甲醯胺DMF）中，在30°C-150°C之間的溫度下，視需要在微波輻射下反應來製備。

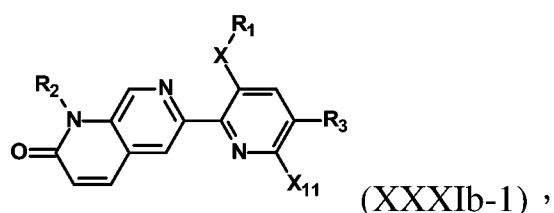
【0178】 大量具有式 (XVIII)、(XVIIIa) 和 (XVIIIaa) 之化合物係可商購的或可由熟悉該項技術者製備。

【0179】 可替代地，具有式I-Qb的化合物（其中X係SO或SO₂）可以由具有式XXXIb的化合物（其中X係SO或SO₂並且其中R₁、R₂、和R₃係如式I中定義的，並且其中X₁₁係脫離基，像例如氯、溴或碘（較佳的是氯或溴），或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯（如三氟甲磺酸酯））藉由涉及與以上所述相同的化學過程但是藉由改變步驟的順序（即，藉由在XXXIb（其中X係S）上進行氧化步驟以形成XXXIb（其中X係SO或SO₂），然後是順序XXXIb（X係SO或SO₂）至XXXIb（X係SO或SO₂）（經由鈴木、施蒂勒或C-N鍵形成））製備。

【0180】 將具有式XXXIb的化合物（其中X係S並且其中R₁、R₂、和R₃係如式I中定義的，並且其中X₁₁係脫離基，像例如氯、溴或碘（較佳的是氯或溴），或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯（如三氟甲磺酸酯））用合適的氧化劑氧化成具有式XXXIb的化合物（其中X係SO或SO₂）可以在以上已經描述的條件下實現。

【0181】 具有式XXXIb的化合物（其中X係S並且其中R₁、R₂、和R₃係如式I中定義的，並且其中X₁₁係脫離基，像例如氯、溴或碘（較佳的是氯或溴），或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯（如三氟甲磺酸酯））可以藉由使具有式XXXb的化合物（其中X係S並且其中R₁、R₂、和R₃係如式I中定義的）與鹵化劑（如三氯氧化磷POCl₃或三溴氧化磷，純的或在合適的溶劑如氯仿或甲苯中），視需要在鹼如三乙胺或吡啶的存在下，在室溫與回流條件之間的溫度下進行反應製備（流程12）。此類去氧鹵化已經描述於例如WO 16/116338中。

【0182】 具有式XXXIb-1的化合物



其中

X係S、SO或SO₂；

X₁₁係鹵素或擬鹵素脫離基；並且

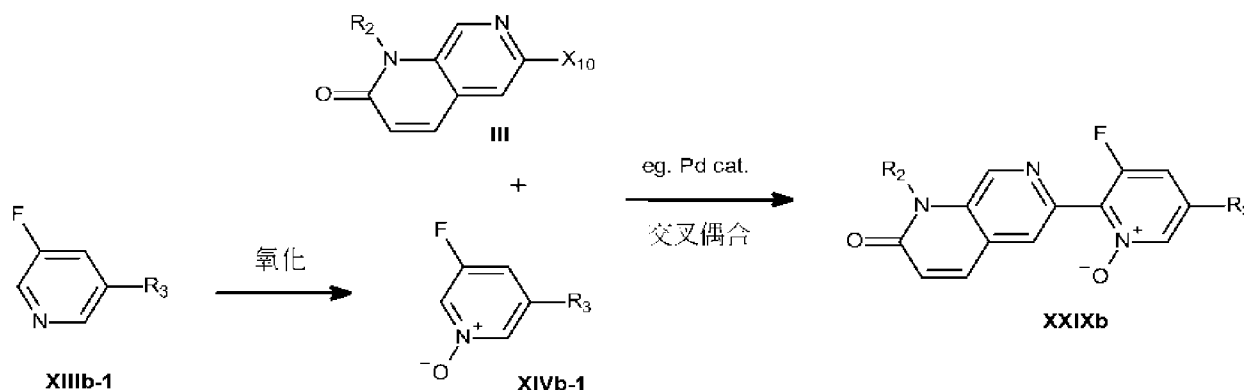
R₁、R₂和R₃係如在請求項1中在式I下定義的，

係新穎的，係為了製備根據本發明的具有式I之化合物而尤其開發的並且因此表示本發明的另一目的。具有式I之化合物的取代基的優先選項和較佳的實施方式對具有式XXXIb-1的化合物也是有效的。較佳的是，X₁₁係溴或氯；甚至更較佳的是，X₁₁係氯。

【0183】 具有式XXXb的化合物（其中X係S並且其中R₁、R₂、和R₃係如式I中定義的）可以藉由使具有式XXIXb的化合物（其中R₂和R₃係如式I中定義的）與具有式VI或VIa的試劑（其中R₁係如式I中定義的）在上文已描述的條件下（參見文本流程3）反應製備。

【0184】 具有式XXIXb的化合物（其中R₂和R₃係如式I中定義的）可以藉由使具有式III的化合物（其中R₂係如以上式I中定義的並且其中X₁₀係鹵素（或擬鹵素脫離基，例如三氟甲磺酸酯），較佳的是溴或氯）與具有式XIVb-1的化合物（其中R₃係如式I中定義的）如流程13中所述之並且在上文已描述的條件下（參見文本流程7和8）交叉偶合製備。

流程13：



【0185】 藉由上述方法(參見文本流程7和8)將具有式XIIIb-1的化合物(其

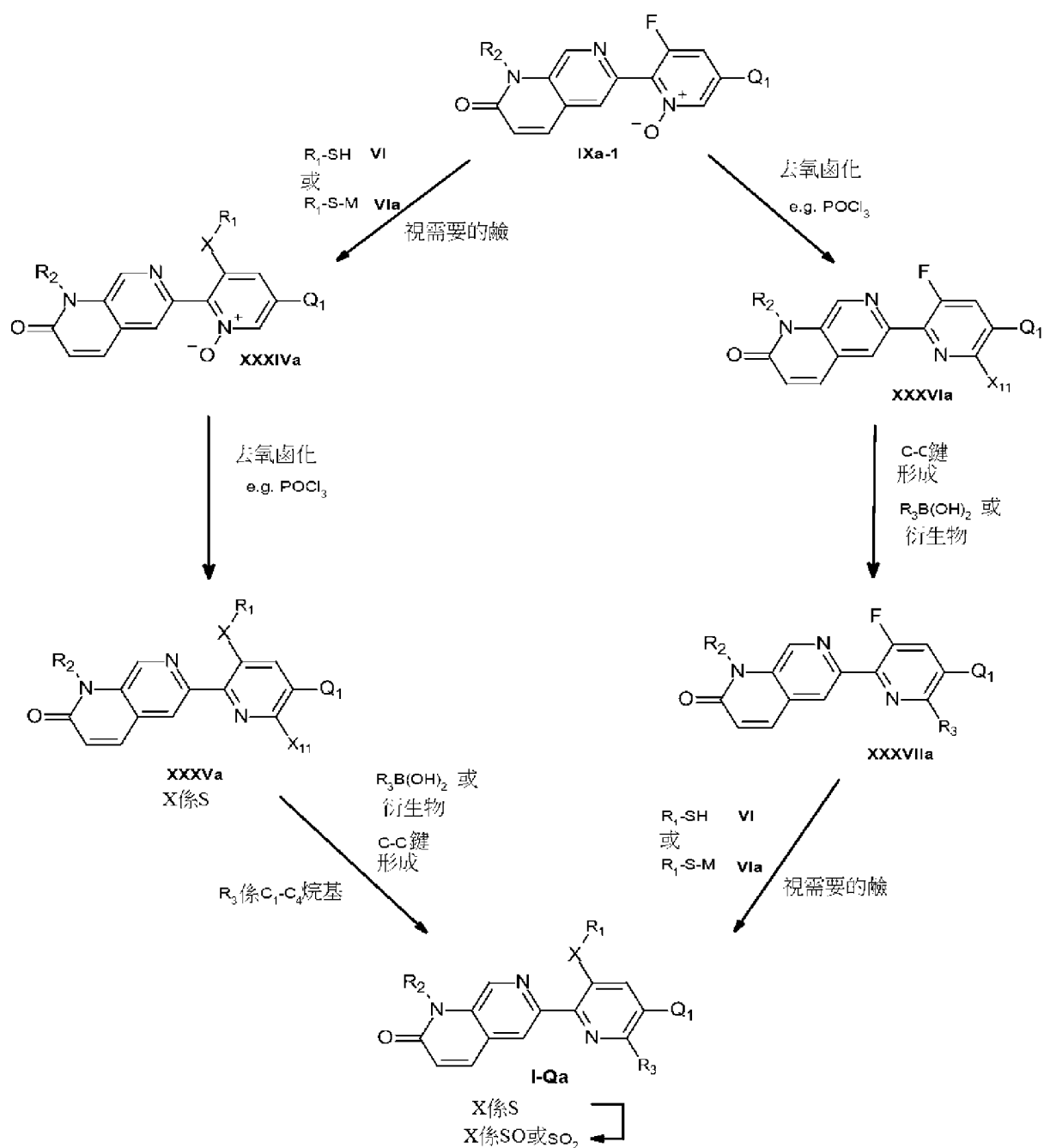
中 R_3 係如式I中定義的) 氧化為具有式XIVb-1的化合物(其中 R_3 係如式I中定義的)。

【0186】 具有式XIIIb-1的化合物(其中 R_3 係如式I中定義的)係已知的、可商購的或可藉由熟悉該項技術者已知之方法製備。

【0187】 可替代地, 具有式I-Qb的化合物(其中X係S、SO或SO₂)可以由具有式XXIXb的化合物藉由涉及與上文描述的相同的化學過程, 但藉由改變該等步驟的順序(即, 藉由進行順序XXIXb至XXXIIb、XXXIIb至XXXIIIb(先前描述的)、以及XXXIIIb至I-Qb, 然後氧化, 並且其中先前提到的所有取代基定義仍然有效)製備(流程12)。

【0188】 在特定情況中, 當 R_3 係C₁-C₄烷基時, 則具有式I-Qa的化合物(其中X係S並且其中 R_1 、 R_2 、 Q_1 和 R_3 係如式I中定義的)

流程14:



【0189】 可以可替代地由具有式XXXVa的化合物(其中X係S並且其中 R_1 、 Q_1 和 R_2 係如式I中定義的，並且其中 X_{11} 係脫離基，像例如氯、溴或碘(較佳的是氯或溴)，或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯(如三氟甲磺酸酯))藉由典型地在鈀催化的(可替代地鎳催化的)交叉偶合條件下的C-C鍵形成反應製備(流程14)。具有式XXXVa的化合物與具有式 $R_3B(OH)_2$ 的 C_1-C_4 烷基硼酸(其中 R_3 係 C_1-C_4 烷基)或對應的 C_1-C_4 烷基硼酸酯衍生物或對應的具有式 $(R_3BO)_3$ 的6員三(C_1-C_4 烷基)硼氧六環衍生物(其中 R_3 係 C_1-C_4 烷基)之間的這種鈴木-宮浦(Suzuki-Miyaura)交叉

偶合反應係熟悉該項技術者眾所周知的。在其中 R_3 係甲基的特定情況中，具有式XXXVa的化合物可以例如與三甲基硼氧六環（也稱為2,4,6-三甲基-1,3,5,2,4,6-三氧雜三硼雜環己烷）在鈮催化劑（如四(三苯基膦)鈮(0)或[1,1'-雙(二苯基膦基)-二茂鐵]二氧化鈮 (II) 二氯甲烷錯合物）和鹼（如碳酸鈉或碳酸鉀）的存在下在溶劑如N,N-二甲基甲醯胺、二噁吡或二噁吡-水混合物中在室溫與160°C之間的溫度下，視需要在微波加熱條件下，並且較佳的是在惰性氣氛下進行反應。此類條件描述於例如Tetrahedron Letters [四面體快報] (2000), 41(32), 6237-6240中。

【0190】 具有式XXXVa的化合物（其中X係S並且其中 R_1 、 R_2 和 Q_1 係如式I中定義的，並且其中 X_{11} 係脫離基，像例如氯、溴或碘（較佳的是氯或溴），或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯（如三氟甲磺酸酯））可以由具有式IXa-1的化合物（經由具有式XXXIVa的化合物）（其中 Q_1 係如式I中定義的）（按順序並且在上文已描述的條件下（參見文本流程12），並且其中先前提到的所有取代基定義仍然有效）製備。

【0191】 可替代地，具有式I-Qa的化合物（其中X係SO或SO₂）可以由具有式XXXVa的化合物（其中X係SO或SO₂並且其中 R_1 、 R_2 、和 Q_1 係如式I中定義的，並且其中 X_{11} 係脫離基，像例如氯、溴或碘（較佳的是氯或溴），或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯（如三氟甲磺酸酯））藉由涉及與以上所述相同的化學過程但是藉由改變步驟的順序（即，藉由在XXXVa（其中X係S）上進行氧化步驟以形成XXXVa（其中X係SO或SO₂），然後是順序XXXVa（X係SO或SO₂）至I-Qa（X係SO或SO₂）（經由與 $R_3B(OH)_2$ 或等效物的C-N鍵形成））製備。

【0192】 將具有式XXXVa的化合物（其中X係S並且其中 R_1 、 R_2 和 Q_1 係如式I中定義的，並且其中 X_{11} 係脫離基，像例如氯、溴或碘（較佳的是氯或溴），或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯（如三氟甲磺酸酯））用合適的氧化劑氧化成具有式XXXVa的化合物（其中X係SO或SO₂）可以在以上已經描述的條件下實現。

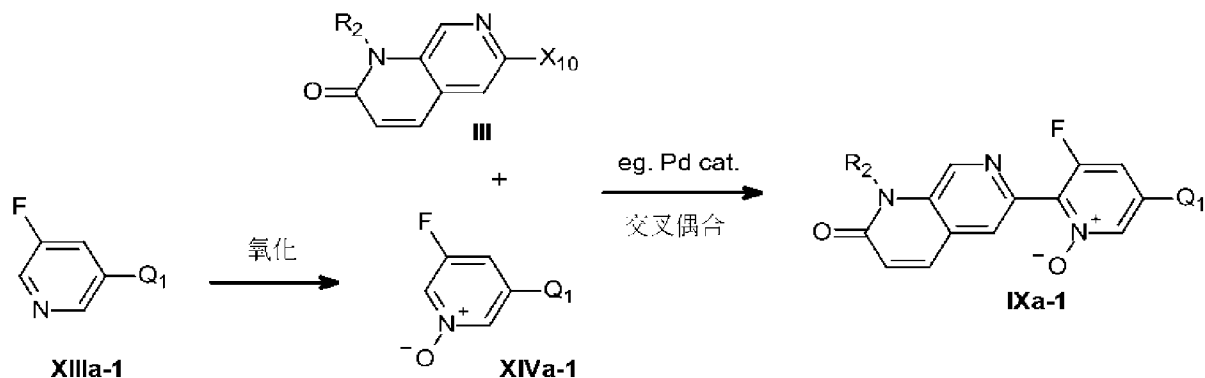
【0193】 可替代地，具有式I-Qa的化合物（其中X係S、SO或SO₂）可以由具有式IXa-1的化合物藉由涉及與上文剛描述的相同的化學過程，但藉由改變該等步驟的順序（即，藉由進行順序IXa-1至XXXVIa、XXXVIa至XXXVIIa（先前描述的）、以及XXXVIIa至I-Qa，然後氧化，並且其中先前提到的所有取代基定義仍然有效）製備（流程14）。

【0194】 在特定情況中，當R₃係氫時，則具有式I-Qa的化合物（其中X係S、SO或SO₂，並且其中R₁、R₂和Q₁係如式I中定義的）可以可替代地由具有式XXXVa的化合物（其中X係S、SO或SO₂並且其中R₁、R₂和Q₁係如式I中定義的，並且其中X₁₁係脫離基，像例如氯、溴或碘（較佳的是氯或溴），或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯（如三氟甲磺酸酯））藉由還原脫鹵製備（流程14）。這樣的加氫脫鹵可以例如使用鋅粉和乙酸或三氟乙酸或其混合物在0°C與120°C之間、較佳的是在50°C與回流溫度之間的溫度下實現，如例如在Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 1: Organic and Bio-Organic Chemistry [英國化學會誌, 普爾金會報1: 有機和生物有機化學] (1972-1999), (10), 2501-6, 1983或US 20100076027中所述。

【0195】 具有式R₃B(OH)₂的C₁-C₄烷基硼酸（其中R₃係C₁-C₄烷基）或對應的C₁-C₄烷基硼酸酯衍生物或對應的具有式(R₃BO)₃的6員三(C₁-C₄烷基)硼氧六環衍生物（其中R₃係C₁-C₄烷基）係已知的、可商購的或可藉由熟悉該項技術者已知之方法製備。

【0196】 具有式IXa-1的化合物（其中R₂和Q₁係如式I中定義的）可以藉由使具有式III的化合物（其中R₂係如以上式I中定義的並且其中X₁₀係鹵素（或擬鹵素脫離基，例如三氟甲磺酸酯），較佳的是溴或氯）與具有式XIVa-1的化合物（其中Q₁係如式I中定義的）如流程15中所述之並且在上文已描述的條件下（參見文本流程7和8）交叉偶合製備。

流程15：

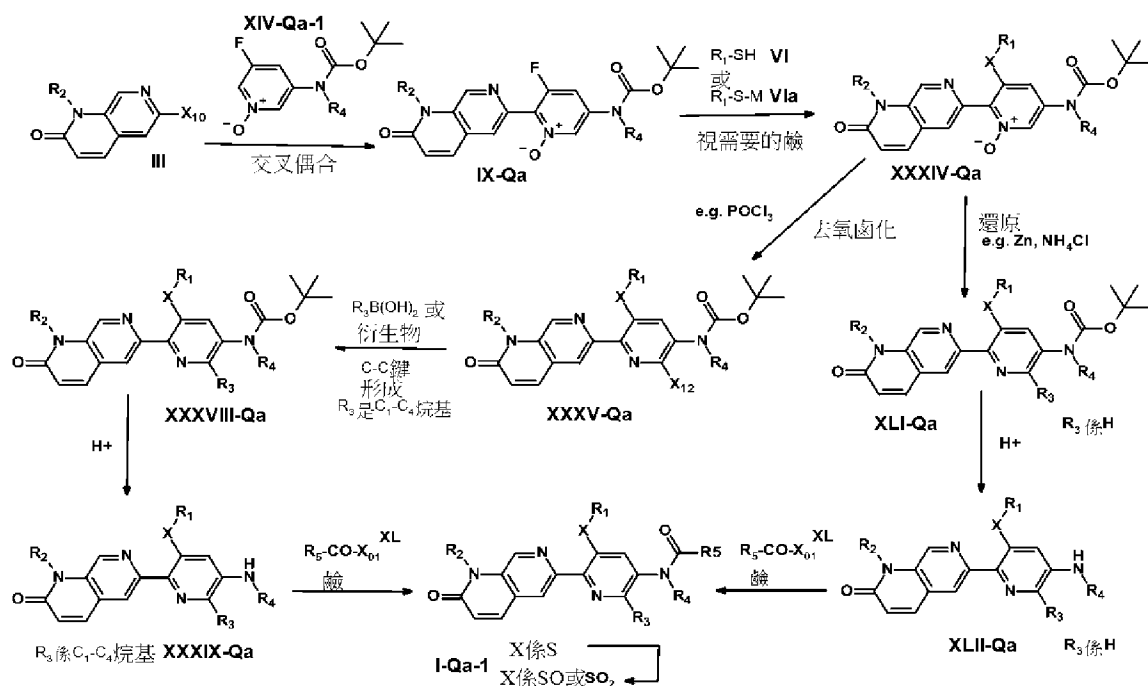


【0197】 藉由上述方法(參見文本流程7和8)將具有式XIIIa-1的化合物(其中 Q_1 係如式I中定義的)氧化為具有式XIVa-1的化合物(其中 Q_1 係如式I中定義的)。

【0198】 具有式XIIIa-1的化合物和具有式XIVa-1的化合物(其中 Q_1 係如式I中定義的)係已知的、可商購的或可藉由熟悉該項技術者已知之方法製備或藉由與例如在WO 20/182577中找到的說明類似地製備。

【0199】 具有式I之化合物的子組(其中 R_2 係如式I中定義的並且其中Q定義為 Q_a , 其中A係N並且 R_3 、X和 R_1 係如式I中定義的, 並且其中 Q_1 係-N(R_4)COR $_5$, 其中 R_4 和 R_5 係如式I中定義的)可以定義為具有式I-Qa-1的化合物(流程16)。

流程16：



【0200】 用適合的氧化劑將具有式I-Qa-1的化合物（其中取代基係如以上定義的，並且其中X係S（硫化物））氧化為對應的化合物（其中X係SO（亞磺）或SO₂（磺））可以在以上已經描述的條件下實現。

【0201】 具有式I-Qa-1的化合物（其中X係S並且R₃係H，並且其中R₂、R₁、R₄和R₅係如式I中定義的）可以藉由使具有式XLII-Qa的化合物（其中X係S並且R₃係H，並且其中R₂、R₁和R₄係如式I中定義的）與具有式XL的化合物（其中R₅係如式I中定義的並且X₀₁係鹵素、較佳的是氯（可替代地，X₀₁係脫離基-O(CO)R₅））在鹼如三乙胺、N,N-二異丙基-乙胺或吡啶的存在下，視需要在催化劑（如4-二甲基胺基吡啶DMAP）的存在下，在惰性溶劑如二氯甲烷、四氫呋喃、二噁咻、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、乙腈、乙酸乙酯或甲苯中在0°C與50°C之間的溫度下反應製備（流程16）。某些鹼（如吡啶和三乙胺）可以成功地既用作鹼又用作溶劑。

【0202】 具有式XLII-Qa的化合物（其中X係S並且R₃係H，並且其中R₂、R₁和R₄係如式I中定義的）可以由具有式XLI-Qa的化合物（其中X係S並且R₃係H，並且其中R₂、R₁和R₄係如式I中定義的）藉由在惰性溶劑如二氯甲烷或四氫呋喃

THF中視需要在水的存在下在0°C與80°C之間的溫度下藉由熟悉該項技術者眾所周知的方法用有機酸例如三氟乙酸、乙酸等，或無機酸如鹽酸進行處理來製備。

【0203】 可替代地，具有式I-Qa-1的化合物（其中X係SO或SO₂）可以由具有式XLI-Qa的化合物（其中X係S並且R₃係H，並且其中R₂、R₁和R₄係如式I中定義的）藉由涉及與上述相同的化學過程，但藉由改變步驟的順序（即，藉由在XLI-Qa（其中X係S）上進行氧化步驟以形成XLI-Qa（其中X係SO或SO₂），然後順序XLI-Qa（X係SO或SO₂）至XLII-Qa（X係SO或SO₂）（經由用酸進行處理），並且XLII-Qa（X係SO或SO₂）至I-Qa-1（X係SO或SO₂）（藉由用具有式XL的試劑進行處理））來製備。

【0204】 具有式XLI-Qa的化合物（其中X係S並且R₃係H，並且其中R₂、R₁和R₄係如式I中定義的）可以藉由以下方式製備：使具有式XXXIV-Qa的化合物（其中X係S，並且其中R₂、R₁和R₄係如式I中定義的）在上文已描述的條件下（參見流程5，化合物X轉化為I-Qa）去氧/還原。

【0205】 可替代地，具有式I-Qa-1的化合物（其中X係S並且R₃係C₁-C₄烷基，並且其中R₂、R₁、R₄和R₅係如式I中定義的）可以藉由使具有式XXXIX-Qa的化合物（其中X係S並且R₃係C₁-C₄烷基，並且其中R₂、R₁和R₄係如式I中定義的）與具有式XL的化合物（其中R₅係如式I中定義的，並且X₀₁係鹵素、較佳的是氯（可替代地，X₀₁係脫離基-O(CO)R₅））在上文已描述的條件下（參見流程16，化合物XLII-Qa轉化為I-Qa-1）反應來製備（流程16）。

【0206】 具有式XXXIX-Qa的化合物（其中X係S並且R₃係C₁-C₄烷基，並且其中R₂、R₁和R₄係如式I中定義的）可以藉由用酸在上文已描述的條件下（參見流程16，化合物XLI-Qa轉化為XLII-Qa）處理具有式XXXVIII-Qa的化合物（其中X係S並且R₃係C₁-C₄烷基，並且其中R₂、R₁和R₄係如式I中定義的）來製備。

【0207】 具有式XXXVIII-Qa的化合物（其中X係S並且R₃係C₁-C₄烷基，並

且其中 R_2 、 R_1 和 R_4 係如式I中定義的)可以藉由使具有式XXXV-Qa的化合物(其中X係S並且其中 R_2 、 R_1 和 R_4 係如式I中定義的,並且其中 X_{12} 係脫離基,像例如氯、溴或碘(較佳的是氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯(如三氟甲磺酸酯))與具有式 $R_3B(OH)_2$ 的 C_1 - C_4 烷基硼酸(其中 R_3 係 C_1 - C_4 烷基)或對應的 C_1 - C_4 烷基硼酸酯衍生物或對應的具有式 $(R_3BO)_3$ 的6員三(C_1 - C_4 烷基)硼氧六環衍生物(其中 R_3 係 C_1 - C_4 烷基)在上文已描述的條件下(參見流程14,藉由C-C鍵形成反應將化合物XXXVa轉化為I-Qa)反應來製備。

【0208】 具有式XXXV-Qa的化合物(其中X係S並且其中 R_2 、 R_1 和 R_4 係如式I中定義的,並且其中 X_{12} 係脫離基,像例如氯、溴或碘(較佳的是氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯(如三氟甲磺酸酯))可以由具有式XXXIV-Qa的化合物(其中X係S並且其中 R_2 、 R_1 和 R_4 係如式I中定義的)藉由在上文已描述的條件下(參見流程14,化合物XXXIVa轉化為XXXVa)的去氧鹵化來製備。

【0209】 具有式XXXIV-Qa的化合物(其中X係S並且其中 R_2 、 R_1 和 R_4 係如式I中定義的)可以藉由使具有式IX-Qa的化合物(其中 R_2 和 R_4 係如式I中定義的)與具有式VI或VIa的試劑(其中 R_1 係如式I中定義的)在上文已描述的條件下(參見文本流程3和5)反應製備。

【0210】 具有式IX-Qa的化合物(其中 R_2 和 R_4 係如式I中定義的)可以藉由使具有式III的化合物(其中 R_2 係如式I中定義的並且其中 X_{10} 係鹵素(或擬鹵素脫離基,例如三氟甲磺酸酯),較佳的是溴或氯)與具有式XIV-Qa-1的化合物(其中 R_4 係如式I中定義的)在上文已描述的條件下(參見文本流程7和15)交叉偶合製備。

【0211】 具有式XIV-Qa-1的化合物(其中 R_4 係如式I中定義的)係已知的、可商購的或可藉由熟悉該項技術者已知之方法製備或藉由與例如在WO 20/182577中找到的說明類似地製備。

【0212】 用適合的氧化劑將流程16中的具有式XXXIV-Qa、XXXV-Qa、XXXVIII-Qa、XXXIX-Qa、XLI-Qa、XLII-Qa和I-Qa-1的任何化合物（其中取代基係如以上定義的，並且其中X係S（硫化物））氧化為對應的化合物（其中X係SO（亞磺）或SO₂（磺））可以在以上已經描述的條件下實現。

【0213】 具有式XL的化合物（其中R₅係如式I中定義的並且X₀₁係鹵素、較佳的是氯（可替代地，X₀₁係脫離基-O(CO)R₅））係已知的、可商購的或可藉由熟悉該項技術者已知之方法製備。

【0214】 該等反應物可以在鹼的存在下進行反應。適合的鹼的實例係鹼金屬或鹼土金屬氫氧化物、鹼金屬或鹼土金屬氫化物、鹼金屬或鹼土金屬醯胺、鹼金屬或鹼土金屬醇鹽、鹼金屬或鹼土金屬乙酸鹽、鹼金屬或鹼土金屬碳酸鹽、鹼金屬或鹼土金屬二烷基醯胺或鹼金屬或鹼土金屬烷基矽基醯胺、烷基胺、仲烷基二胺、游離的或N-烷基化的飽和或不飽和的環烷基胺、鹼性雜環、氫氧化銨以及碳環胺。可以提及的實例係氫氧化鈉、氫化鈉、胺基鈉、甲醇鈉、乙酸鈉、碳酸鈉、三級丁醇鉀、氫氧化鉀、碳酸鉀、氫化鉀、二異丙胺基鋰、雙(三甲基矽基)醯胺鉀、氫化鈣、三乙胺、二異丙基乙胺、三伸乙基二胺、環己胺、N-環己基-N,N-二甲胺、N,N-二乙苯胺、吡啶、4-(N,N-二甲基胺基)吡啶、吡啶、N-甲基咪啉、苄基三甲基銨氫氧化物以及1,8-二氮雜雙環[5.4.0]十一碳-7-烯（DBU）。

【0215】 該等反應物可以按照原樣彼此進行反應，即：不添加溶劑或稀釋劑。然而，在大多數情況下，加入惰性溶劑或稀釋劑或該等的混合物係有利的。如果該反應在鹼的存在下進行，那麼該等過量使用的鹼（如三乙胺、吡啶、N-甲基咪啉或N,N-二乙苯胺）還可以充當溶劑或稀釋劑。

【0216】 該等反應有利地在從約-80°C到約+140°C、較佳的是從約-30°C到約+100°C的溫度範圍內，在許多情況下在環境溫度與約+80°C之間的範圍內進行。

【0217】 藉由以常規方式用根據本發明的一個或多個其他取代基取代具有式I之起始化合物的一個或多個取代基，並藉由用反應（如氧化、烷基化、還原、醃化和熟悉該項技術者已知的其他方法）對化合物進行後修飾，可以將具有式I之化合物以本身已知的方式轉化成另一種具有式I之化合物。

【0218】 取決於所選的適合各自情況的反應條件以及起始材料，有可能例如，在一個反應步驟中僅將一個取代基用根據本發明的另一個取代基替代，或者在同一個反應步驟中可以將多個取代基用根據本發明的其他取代基來替代。

【0219】 具有式I之化合物的鹽能以本身已知的方式來製備。因此，例如，具有式I之化合物的酸加成鹽係藉由用適合的酸或適合的離子交換劑試劑進行處理來獲得的，並且與鹼的鹽係藉由用適合的鹼或用適合的離子交換劑試劑進行處理來獲得的。

【0220】 具有式I之化合物的鹽能以常規方式轉化為游離的化合物 I、酸加成鹽（例如藉由用適合的鹼性化合物或用適合的離子交換劑試劑進行處理）以及與鹼的鹽（例如藉由用適合的酸或用適合的離子交換劑試劑進行處理）。

【0221】 具有式I之化合物的鹽能以本身已知的方式轉化為具有式I之化合物的其他鹽、酸加成鹽，例如轉化成其他酸加成鹽，例如藉由在適合的溶劑中用酸的適合的金屬鹽（如鈉、鋇或銀的鹽，例如用乙酸銀）來處理無機酸的鹽（如鹽酸鹽），在該溶劑中，所形成的無機鹽（例如氯化銀）係不溶的並且因此從該反應混合物中沈澱出。

【0222】 取決於程序或反應條件，具有成鹽特性的該等具有式I之化合物能以游離形式或鹽的形式獲得。

【0223】 取決於分子中存在的不對稱碳原子的數目、絕對和相對組態和/或取決於分子中存在的非芳香族雙鍵的組態，具有式I之化合物和適當時其互變異構物（在每種情況下呈游離形式或呈鹽形式）可以以可能的異構物之一的形式

或作為該等的混合物存在，例如以純異構物的形式，如鏡像異構體和/或非鏡像異構物，或作為異構物混合物，如鏡像異構物混合物，例如外消旋物、非鏡像異構物混合物或外消旋物混合物存在；本發明關於純異構物以及還有所有可能的異構物混合物，並且在上文和下文中在每種情況下都應如此理解，即使立體化學細節未在每種情況下明確提及。

【0224】 呈游離形式或呈鹽形式的具有式I之化合物的非鏡像異構物混合物或外消旋物混合物（它們的獲得可以取決於已選定的起始材料和程序）能夠在該等組分的物理化學差異的基礎上，例如藉由分段結晶、蒸餾和/或層析法以已知的方式分離成純的非鏡像異構物或外消旋物。

【0225】 能夠以類似方式獲得的鏡像異構物混合物（如外消旋物）可以藉由已知方法拆分成光學鏡像異構體，例如藉由從光學活性溶劑再結晶；藉由在手性吸附劑上的層析法，例如在乙醯纖維素上的高效液相層析法（HPLC）；借助於適合的微生物，藉由用特異性固定化酶裂解；藉由形成包容化合物，例如使用手性冠醚，其中僅一個鏡像異構物被錯合；或藉由轉化成非鏡像異構物的鹽，例如藉由使鹼性最終產物外消旋物與光學活性酸（如羧酸，例如樟腦酸、酒石酸或蘋果酸，或磺酸，例如樟腦磺酸）反應，並且分離能夠以此方式獲得的非鏡像異構物混合物，例如基於其不同溶解度藉由分段結晶，從而獲得非鏡像異構物，從該非鏡像異構物可以藉由適合的試劑（例如鹼性試劑）的作用使所希望的鏡像異構物變成游離的。

【0226】 純的非鏡像異構物或鏡像異構物能根據本發明來獲得，不僅是藉由分離適合的異構物混合物，還可以是藉由普遍已知的非鏡像異構物立體選擇性或鏡像異構物選擇性合成之方法，例如藉由根據本發明用具有適合的立體化學的起始材料進行該方法。

【0227】 可以藉由使具有式I之化合物與適合的氧化劑（例如 H_2O_2 /尿素加

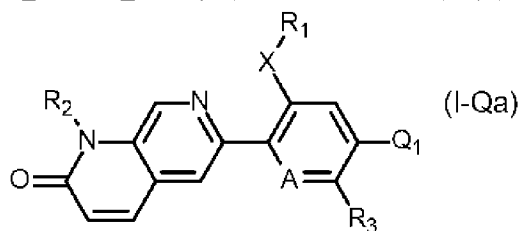
合物)在酸酐(例如三氟乙酸酐)的存在下進行反應來製備N-氧化物。此類氧化從文獻中,例如從*J. Med. Chem.* [藥物化學雜誌], 32 (12), 2561-73, 1989或WO 2000/15615中是已知的。

【0228】 如果單個組分具有不同的生物活性,有利的是在每一情況下分離或合成生物學上更有效的異構物,例如鏡像異構物或非鏡像異構物或異構物混合物,例如鏡像異構物混合物或非鏡像異構物混合物。

【0229】 如果適當的話,具有式I之化合物和適當時其互變異構物(在每種情況下呈游離形式或呈鹽形式)還能以水合物的形式獲得和/或包括其他溶劑,例如可以用於使以固體形式存在的化合物結晶的那些。

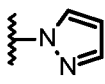
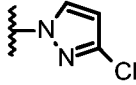
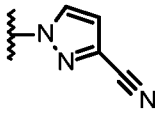
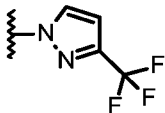
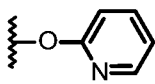
【0230】 根據下表A-1至A-60和下表B-1至B-60的化合物可以根據以上描述之方法製備。以下實例旨在說明本發明並且示出較佳的具有式I之化合物。

【0231】 下表A-1至A-60說明了本發明的另外的具體化合物。



表Y: Q₁的取代基定義:

索引	Q ₁	索引	Q ₁
1	H	11	-N(CH ₃)COCH ₃
2	-N(CH ₃)COCH ₂ CH ₃	12	
3	Cl	13	
4	Br	14	
5	-N(CH ₃)COcycloC3	15	-OCH ₂ CF ₃

6	CF ₃	16	
7	-NH ₂	17	
8	-NH(CH ₃)	18	
9	-N(CH ₃) ₂	19	
10	-NHCOCH ₃	20	

【0232】 在表Y和表A中，「cycloC3」表示環丙基。

【0233】 表A-1提供了20種具有式I-Qa的化合物A-1.001至A-1.020，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係N，R₃係H，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0234】 表A-2提供了20種具有式I-Qa的化合物A-2.001至A-2.020，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係N，R₃係H，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0235】 表A-3提供了20種具有式I-Qa的化合物A-3.001至A-3.020，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係N，R₃係H，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0236】 表A-4提供了20種具有式I-Qa的化合物A-4.001至A-4.020，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係N，R₃係Me，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0237】 表A-5提供了20種具有式I-Qa的化合物A-5.001至A-5.020，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係N，R₃係Me，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0238】 表A-6提供了20種具有式I-Qa的化合物A-6.001至A-6.020，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係N，R₃係Me，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0239】 表A-7提供了20種具有式I-Qa的化合物A-7.001至A-7.020，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係CH，R₃係H，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0240】 表A-8提供了20種具有式I-Qa的化合物A-8.001至A-8.020，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係CH，R₃係H，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0241】 表A-9提供了20種具有式I-Qa的化合物A-9.001至A-9.020，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係CH，R₃係H，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0242】 表A-10提供了20種具有式I-Qa的化合物A-10.001至A-10.020，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係CH，R₃係Me，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0243】 表A-11提供了20種具有式I-Qa的化合物A-11.001至A-11.020，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係CH，R₃係Me，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0244】 表A-12提供了20種具有式I-Qa的化合物A-12.001至A-12.020，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係CH，R₃係Me，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0245】 表A-13提供了20種具有式I-Qa的化合物A-13.001至A-13.020，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂，A係N，R₃係H，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0246】 表A-14提供了20種具有式I-Qa的化合物A-14.001至A-14.020，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂，A係N，R₃係H，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0247】 表A-15提供了20種具有式I-Qa的化合物A-15.001至A-15.020，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂，A係N，R₃係H，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0248】 表A-16提供了20種具有式I-Qa的化合物A-16.001至A-16.020，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂，A係N，R₃係Me，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0249】 表A-17提供了20種具有式I-Qa的化合物A-17.001至A-17.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF_2$ ，A係N， R_3 係Me，X係SO， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0250】 表A-18提供了20種具有式I-Qa的化合物A-18.001至A-18.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF_2$ ，A係N， R_3 係Me，X係 SO_2 ， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0251】 表A-19提供了20種具有式I-Qa的化合物A-19.001至A-19.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF_2$ ，A係CH， R_3 係H，X係S， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0252】 表A-20提供了20種具有式I-Qa的化合物A-20.001至A-20.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF_2$ ，A係CH， R_3 係H，X係SO， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0253】 表A-21提供了20種具有式I-Qa的化合物A-21.001至A-21.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF_2$ ，A係CH， R_3 係H，X係 SO_2 ， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0254】 表A-22提供了20種具有式I-Qa的化合物A-22.001至A-22.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF_2$ ，A係CH， R_3 係Me，X係S， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0255】 表A-23提供了20種具有式I-Qa的化合物A-23.001至A-23.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF_2$ ，A係CH， R_3 係Me，X係SO， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0256】 表A-24提供了20種具有式I-Qa的化合物A-24.001至A-24.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF_2$ ，A係CH， R_3 係Me，X係 SO_2 ， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0257】 表A-25提供了20種具有式I-Qa的化合物A-25.001至A-25.020，其中R₂係CH₂CF₃，A係N，R₃係H，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0258】 表A-26提供了20種具有式I-Qa的化合物A-26.001至A-26.020，其中R₂係CH₂CF₃，A係N，R₃係H，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0259】 表A-27提供了20種具有式I-Qa的化合物A-27.001至A-27.020，其中R₂係CH₂CF₃，A係N，R₃係H，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0260】 表A-28提供了20種具有式I-Qa的化合物A-28.001至A-28.020，其中R₂係CH₂CF₃，A係N，R₃係Me，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0261】 表A-29提供了20種具有式I-Qa的化合物A-29.001至A-29.020，其中R₂係CH₂CF₃，A係N，R₃係Me，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0262】 表A-30提供了20種具有式I-Qa的化合物A-30.001至A-30.020，其中R₂係CH₂CF₃，A係N，R₃係Me，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0263】 表A-31提供了20種具有式I-Qa的化合物A-31.001至A-31.020，其中R₂係CH₂CF₃，A係CH，R₃係H，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0264】 表A-32提供了20種具有式I-Qa的化合物A-32.001至A-32.020，其中R₂係CH₂CF₃，A係CH，R₃係H，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0265】 表A-33提供了20種具有式I-Qa的化合物A-33.001至A-33.020，其中R₂係CH₂CF₃，A係CH，R₃係H，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0266】 表A-34提供了20種具有式I-Qa的化合物A-34.001至A-34.020，其中R₂係CH₂CF₃，A係CH，R₃係Me，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0267】 表A-35提供了20種具有式I-Qa的化合物A-35.001至A-35.020，其中R₂係CH₂CF₃，A係CH，R₃係Me，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0268】 表A-36提供了20種具有式I-Qa的化合物A-36.001至A-36.020，其中R₂係CH₂CF₃，A係CH，R₃係Me，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0269】 表A-37提供了20種具有式I-Qa的化合物A-37.001至A-37.020，其中R₂係CH₂CHF₂，A係N，R₃係H，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0270】 表A-38提供了20種具有式I-Qa的化合物A-38.001至A-38.020，其中R₂係CH₂CHF₂，A係N，R₃係H，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0271】 表A-39提供了20種具有式I-Qa的化合物A-39.001至A-39.020，其中R₂係CH₂CHF₂，A係N，R₃係H，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0272】 表A-40提供了20種具有式I-Qa的化合物A-40.001至A-40.020，其中R₂係CH₂CHF₂，A係N，R₃係Me，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0273】 表A-41提供了20種具有式I-Qa的化合物A-41.001至A-41.020，其中R₂係CH₂CHF₂，A係N，R₃係Me，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0274】 表A-42提供了20種具有式I-Qa的化合物A-42.001至A-42.020，其中R₂係CH₂CHF₂，A係N，R₃係Me，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0275】 表A-43提供了20種具有式I-Qa的化合物A-43.001至A-43.020，其中R₂係CH₂CHF₂，A係CH，R₃係H，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0276】 表A-44提供了20種具有式I-Qa的化合物A-44.001至A-44.020，其中R₂係CH₂CHF₂，A係CH，R₃係H，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0277】 表A-45提供了20種具有式I-Qa的化合物A-45.001至A-45.020，其中R₂係CH₂CHF₂，A係CH，R₃係H，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0278】 表A-46提供了20種具有式I-Qa的化合物A-46.001至A-46.020，其中R₂係CH₂CHF₂，A係CH，R₃係Me，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0279】 表A-47提供了20種具有式I-Qa的化合物A-47.001至A-47.020，其中R₂係CH₂CHF₂，A係CH，R₃係Me，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Y中定義的。

【0280】 表A-48提供了20種具有式I-Qa的化合物A-48.001至A-48.020，其

中 R_2 係 CH_2CHF_2 ，A係CH， R_3 係Me，X係 SO_2 ， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0281】 表A-49提供了20種具有式I-Qa的化合物A-49.001至A-49.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF_2$ ，A係N， R_3 係H，X係S， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0282】 表A-50提供了20種具有式I-Qa的化合物A-50.001至A-50.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF_2$ ，A係N， R_3 係H，X係SO， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0283】 表A-51提供了20種具有式I-Qa的化合物A-51.001至A-51.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF_2$ ，A係N， R_3 係H，X係 SO_2 ， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0284】 表A-52提供了20種具有式I-Qa的化合物A-52.001至A-52.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF_2$ ，A係N， R_3 係Me，X係S， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0285】 表A-53提供了20種具有式I-Qa的化合物A-53.001至A-53.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF_2$ ，A係N， R_3 係Me，X係SO， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0286】 表A-54提供了20種具有式I-Qa的化合物A-54.001至A-54.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF_2$ ，A係N， R_3 係Me，X係 SO_2 ， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0287】 表A-55提供了20種具有式I-Qa的化合物A-55.001至A-55.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF_2$ ，A係CH， R_3 係H，X係S， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0288】 表A-56提供了20種具有式I-Qa的化合物A-56.001至A-56.020，其

中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF CF_3$ ， A 係 CH ， R_3 係 H ， X 係 SO ， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

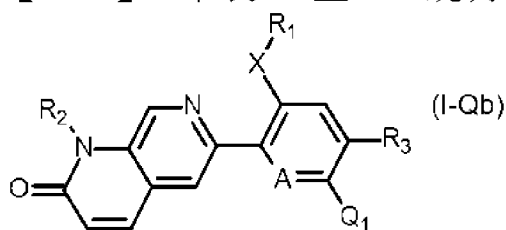
【0289】 表A-57提供了20種具有式I-Qa的化合物A-57.001至A-57.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF CF_3$ ， A 係 CH ， R_3 係 H ， X 係 SO_2 ， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0290】 表A-58提供了20種具有式I-Qa的化合物A-58.001至A-58.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF CF_3$ ， A 係 CH ， R_3 係 Me ， X 係 S ， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0291】 表A-59提供了20種具有式I-Qa的化合物A-59.001至A-59.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF CF_3$ ， A 係 CH ， R_3 係 Me ， X 係 SO ， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0292】 表A-60提供了20種具有式I-Qa的化合物A-60.001至A-60.020，其中 R_2 係 $CH_2CF_2CHF CF_3$ ， A 係 CH ， R_3 係 Me ， X 係 SO_2 ， R_1 係乙基並且 Q_1 係如表Y中定義的。

【0293】 下表B-1至B-60說明了本發明的另外的具體化合物。



表Z： Q_1 的取代基定義：

索引	Q_1	索引	Q_1
1	H	12	
2	Cl	13	-N(H)CONH ₂
3	Br	14	-N(H)CONH(CH ₃)
4	-N(CH ₃)COCH ₂ CH ₃	15	-N(H)CON(CH ₃) ₂
5	-NH ₂	16	-N(CH ₃)CONH ₂

索引	Q ₁	索引	Q ₁
6	-NH(CH ₃)	17	
7	-N(CH ₃) ₂	18	
8	-NHCOCH ₃	19	
9	-N(CH ₃)COCH ₃	20	
10	-NHCOcycloC3	21	
11	-N(CH ₃)COcycloC3		

【0294】 在表Z和表B中，「cycloC3」表示環丙基。

【0295】 表B-1提供了21種具有式I-Qb的化合物B-1.001至B-1.021，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係N，R₃係H，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0296】 表B-2提供了21種具有式I-Qb的化合物B-2.001至B-2.021，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係N，R₃係H，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0297】 表B-3提供了21種具有式I-Qb的化合物B-3.001至B-3.021，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係N，R₃係H，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0298】 表B-4提供了21種具有式I-Qb的化合物B-4.001至B-4.021，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係N，R₃係Me，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0299】 表B-5提供了21種具有式I-Qb的化合物B-5.001至B-5.021，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係N，R₃係Me，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0300】 表B-6提供了21種具有式I-Qb的化合物B-6.001至B-6.021，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係N，R₃係Me，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0301】 表B-7提供了21種具有式I-Qb的化合物B-7.001至B-7.021，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係CH，R₃係H，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0302】 表B-8提供了21種具有式I-Qb的化合物B-8.001至B-8.021，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係CH，R₃係H，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0303】 表B-9提供了21種具有式I-Qb的化合物B-9.001至B-9.021，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係CH，R₃係H，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0304】 表B-10提供了21種具有式I-Qb的化合物B-10.001至B-10.021，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係CH，R₃係Me，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0305】 表B-11提供了21種具有式I-Qb的化合物B-11.001至B-11.021，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係CH，R₃係Me，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0306】 表B-12提供了21種具有式I-Qb的化合物B-12.001至B-12.021，其中R₂係CH₂CF₂CF₃，A係CH，R₃係Me，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0307】 表B-13提供了21種具有式I-Qb的化合物B-13.001至B-13.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂，A係N，R₃係H，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0308】 表B-14提供了21種具有式I-Qb的化合物B-14.001至B-14.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂，A係N，R₃係H，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0309】 表B-15提供了21種具有式I-Qb的化合物B-15.001至B-15.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂，A係N，R₃係H，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0310】 表B-16提供了21種具有式I-Qb的化合物B-16.001至B-16.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂，A係N，R₃係Me，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0311】 表B-17提供了21種具有式I-Qb的化合物B-17.001至B-17.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂，A係N，R₃係Me，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0312】 表B-18提供了21種具有式I-Qb的化合物B-18.001至B-18.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂，A係N，R₃係Me，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0313】 表B-19提供了21種具有式I-Qb的化合物B-19.001至B-19.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂，A係CH，R₃係H，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0314】 表B-20提供了21種具有式I-Qb的化合物B-20.001至B-20.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂，A係CH，R₃係H，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0315】 表B-21提供了21種具有式I-Qb的化合物B-21.001至B-21.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂，A係CH，R₃係H，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0316】 表B-22提供了21種具有式I-Qb的化合物B-22.001至B-22.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂，A係CH，R₃係Me，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0317】 表B-23提供了21種具有式I-Qb的化合物B-23.001至B-23.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂，A係CH，R₃係Me，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0318】 表B-24提供了21種具有式I-Qb的化合物B-24.001至B-24.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂，A係CH，R₃係Me，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0319】 表B-25提供了21種具有式I-Qb的化合物B-25.001至B-25.021，其中R₂係CH₂CF₃，A係N，R₃係H，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0320】 表B-26提供了21種具有式I-Qb的化合物B-26.001至B-26.021，其中R₂係CH₂CF₃，A係N，R₃係H，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0321】 表B-27提供了21種具有式I-Qb的化合物B-27.001至B-27.021，其中R₂係CH₂CF₃，A係N，R₃係H，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0322】 表B-28提供了21種具有式I-Qb的化合物B-28.001至B-28.021，其中R₂係CH₂CF₃，A係N，R₃係Me，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0323】 表B-29提供了21種具有式I-Qb的化合物B-29.001至B-29.021，其中R₂係CH₂CF₃，A係N，R₃係Me，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0324】 表B-30提供了21種具有式I-Qb的化合物B-30.001至B-30.021，其中R₂係CH₂CF₃，A係N，R₃係Me，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0325】 表B-31提供了21種具有式I-Qb的化合物B-31.001至B-31.021，其中R₂係CH₂CF₃，A係CH，R₃係H，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0326】 表B-32提供了21種具有式I-Qb的化合物B-32.001至B-32.021，其中R₂係CH₂CF₃，A係CH，R₃係H，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0327】 表B-33提供了21種具有式I-Qb的化合物B-33.001至B-33.021，其中R₂係CH₂CF₃，A係CH，R₃係H，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0328】 表B-34提供了21種具有式I-Qb的化合物B-34.001至B-34.021，其中R₂係CH₂CF₃，A係CH，R₃係Me，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0329】 表B-35提供了21種具有式I-Qb的化合物B-35.001至B-35.021，其中R₂係CH₂CF₃，A係CH，R₃係Me，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0330】 表B-36提供了21種具有式I-Qb的化合物B-36.001至B-36.021，其中R₂係CH₂CF₃，A係CH，R₃係Me，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0331】 表B-37提供了21種具有式I-Qb的化合物B-37.001至B-37.021，其中R₂係CH₂CHF₂，A係N，R₃係H，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0332】 表B-38提供了21種具有式I-Qb的化合物B-38.001至B-38.021，其中R₂係CH₂CHF₂，A係N，R₃係H，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0333】 表B-39提供了21種具有式I-Qb的化合物B-39.001至B-39.021，其中R₂係CH₂CHF₂，A係N，R₃係H，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0334】 表B-40提供了21種具有式I-Qb的化合物B-40.001至B-40.021，其中R₂係CH₂CHF₂，A係N，R₃係Me，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0335】 表B-41提供了21種具有式I-Qb的化合物B-41.001至B-41.021，其中R₂係CH₂CHF₂，A係N，R₃係Me，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0336】 表B-42提供了21種具有式I-Qb的化合物B-42.001至B-42.021，其中R₂係CH₂CHF₂，A係N，R₃係Me，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0337】 表B-43提供了21種具有式I-Qb的化合物B-43.001至B-43.021，其中R₂係CH₂CHF₂，A係CH，R₃係H，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0338】 表B-44提供了21種具有式I-Qb的化合物B-44.001至B-44.021，其中R₂係CH₂CHF₂，A係CH，R₃係H，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0339】 表B-45提供了21種具有式I-Qb的化合物B-45.001至B-45.021，其中R₂係CH₂CHF₂，A係CH，R₃係H，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0340】 表B-46提供了21種具有式I-Qb的化合物B-46.001至B-46.021，其中R₂係CH₂CHF₂，A係CH，R₃係Me，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0341】 表B-47提供了21種具有式I-Qb的化合物B-47.001至B-47.021，其中R₂係CH₂CHF₂，A係CH，R₃係Me，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0342】 表B-48提供了21種具有式I-Qb的化合物B-48.001至B-48.021，其中R₂係CH₂CHF₂，A係CH，R₃係Me，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義

的。

【0343】 表B-49提供了21種具有式I-Qb的化合物B-49.001至B-49.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂CF₃，A係N，R₃係H，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0344】 表B-50提供了21種具有式I-Qb的化合物B-50.001至B-50.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂CF₃，A係N，R₃係H，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0345】 表B-51提供了21種具有式I-Qb的化合物B-51.001至B-51.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂CF₃，A係N，R₃係H，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0346】 表B-52提供了21種具有式I-Qb的化合物B-52.001至B-52.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂CF₃，A係N，R₃係Me，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0347】 表B-53提供了21種具有式I-Qb的化合物B-53.001至B-53.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂CF₃，A係N，R₃係Me，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0348】 表B-54提供了21種具有式I-Qb的化合物B-54.001至B-54.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂CF₃，A係N，R₃係Me，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0349】 表B-55提供了21種具有式I-Qb的化合物B-55.001至B-55.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂CF₃，A係CH，R₃係H，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0350】 表B-56提供了21種具有式I-Qb的化合物B-56.001至B-56.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂CF₃，A係CH，R₃係H，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定

義的。

【0351】 表B-57提供了21種具有式I-Qb的化合物B-57.001至B-57.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂CF₃，A係CH，R₃係H，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0352】 表B-58提供了21種具有式I-Qb的化合物B-58.001至B-58.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂CF₃，A係CH，R₃係Me，X係S，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0353】 表B-59提供了21種具有式I-Qb的化合物B-59.001至B-59.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂CF₃，A係CH，R₃係Me，X係SO，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0354】 表B-60提供了21種具有式I-Qb的化合物B-60.001至B-60.021，其中R₂係CH₂CF₂CHF₂CF₃，A係CH，R₃係Me，X係SO₂，R₁係乙基並且Q₁係如表Z中定義的。

【0355】 根據本發明的具有式I之化合物在有害生物控制領域中是有預防和/或治療價值的活性成分，即使係在低的施用量下，它們具有非常有利的殺生物譜並且是溫血物種、魚以及植物良好耐受的。根據本發明的該等活性成分作用於正常敏感的以及還有抗性的動物有害生物（如昆蟲或蜱蟎目的代表）的所有的或個別的發育階段。根據本發明的活性成分的殺昆蟲或殺蟎活性可以本身直接顯現出來，即立即或僅在過去一些時間之後（例如在蛻皮期間）發生對有害生物的破壞；或間接顯現出來，例如降低產卵和/或孵化率，對應於至少50%至60%的破壞率（死亡率）的良好活性。

【0356】 以上提及的動物有害生物的實例係：

來自蜱蟎目，例如

下毛癭蟎屬物種（*Acalitus* spp.）、針刺癭蟎屬物種（*Aculus* spp.）、窄癭蟎屬

物種 (*Acaricalus* spp.)、瘤瘿蟎屬物種 (*Aceria* spp.)、粗腳粉蟎 (*Acarus siro*)、鈍眼蜱屬物種 (*Amblyomma* spp.)、銳緣蜱屬物種 (*Argas* spp.)、牛蜱屬物種 (*Boophilus* spp.)、短須蟎屬物種 (*Brevipalpus* spp.)、苔蟎屬物種 (*Bryobia* spp.)、上三脊瘿蟎屬物種 (*Calipitrimerus* spp.)、皮蟎屬物種 (*Chorioptes* spp.)、雞皮刺蟎 (*Dermanyssus gallinae*)、表皮蟎屬物種 (*Dermatophagoides* spp.)、始葉蟎屬物種 (*Eotetranychus* spp.)、瘿蟎屬物種 (*Eriophyes* spp.)、半跗線蟎屬物種 (*Hemitarsonemus* spp.)、璃眼蜱屬物種 (*Hyalomma* spp.)、硬蜱屬物種 (*Ixodes* spp.)、小爪蟎屬物種 (*Olygonychus* spp.)、鈍緣蜱屬物種 (*Ornithodoros* spp.)、側多食跗線蟎 (*Polyphagotarsonella latus*)、全爪蟎屬物種 (*Panonychus* spp.)、桔芸鏽蟎 (*Phyllocoptruta oleivora*)、植食蟎屬物種 (*Phytonemus* spp.)、多食跗線蟎屬物種 (*Polyphagotarsonemus* spp.)、癢蟎屬物種 (*Psoroptes* spp.)、扇頭蜱屬物種 (*Rhipicephalus* spp.)、根蟎屬物種 (*Rhizoglyphus* spp.)、疥蟎屬物種 (*Sarcoptes* spp.)、狹跗線蟎屬物種 (*Steneotarsonemus* spp.)、跗線蟎屬物種 (*Tarsonemus* spp.) 以及葉蟎屬物種 (*Tetranychus* spp.)；

來自虱目，例如

血虱屬物種 (*Haematopinus* spp.)、長顎虱屬物種 (*Linognathus* spp.)、人虱屬物種 (*Pediculus* spp.)、瘿綿蚜屬物種 (*Pemphigus* spp.) 以及根瘤蚜屬物種 (*Phylloxera* spp.)；

來自鞘翅目，例如

叩甲屬物種 (*Agriotes* spp.)、歐洲鰓角金龜 (*Amphimallon majale*)、東方異麗金龜 (*Anomala orientalis*)、花象屬物種 (*Anthonomus* spp.)、蜉金龜屬物種 (*Aphodius* spp.)、玉米擬花螢 (*Astylus atromaculatus*)、金龜屬物種 (*Ataenius* spp.)、甜菜隱食甲 (*Atomaria linearis*)、甜菜脛跳甲 (*Chaetocnema tibialis*)、螢葉甲屬物種 (*Cerotoma* spp.)、寬胸叩頭蟲屬物種 (*Conoderus* spp.)、根頸象屬物

種 (*Cosmopolites* spp.)、綠花金龜 (*Cotinis nitida*)、象蟲屬物種 (*Curculio* spp.)、圓頭犀金龜屬物種 (*Cyclocephala* spp.)、皮蠹屬物種 (*Dermestes* spp.)、根螢葉甲屬物種 (*Diabrotica* spp.)、阿根廷兜蟲 (*Diloboderus abderus*)、食植瓢蟲屬物種 (*Epilachna* spp.)、*Eremnus*屬物種、黑異爪蔗金龜 (*Heteronychus arator*)、咖啡果小蠹 (*Hypothenemus hampei*)、*Lagria vilosa*、馬鈴薯甲蟲 (*Leptinotarsa decemlineata*)、稻水象屬物種 (*Lissorhoptrus* spp.)、*Liogenys*屬物種、*Maecolaspis*屬物種、栗色絨金龜 (*Maladera castanea*)、美洲葉甲屬物種 (*Megascelis* spp.)、油菜花露尾甲 (*Melighetes aeneus*)、鰓金龜屬物種 (*Melolontha* spp.)、*Myochrous armatus*、鋸穀盜屬物種 (*Oryzaeophilus* spp.)、耳喙象屬物種 (*Otiorhynchus* spp.)、鰓角金龜屬物種 (*Phyllophaga* spp.)、斑象屬物種 (*Phlyctinus* spp.)、弧麗金龜屬物種 (*Popillia* spp.)、蚤跳甲屬物種 (*Psylliodes* spp.)、*Rhyssomatus aubtilis*、劫根蠹屬物種 (*Rhizopertha* spp.)、金龜子科 (*Scarabeidae*)、米象屬物種 (*Sitophilus* spp.)、麥蛾屬物種 (*Sitotroga* spp.)、偽切根蟲屬物種 (*Somaticus* spp.)、尖隱喙象屬物種、大豆莖象 (*Sternechus subsignatus*)、擬步行蟲屬物種 (*Tenebrio* spp.)、擬穀盜屬物種 (*Tribolium* spp.) 以及斑皮蠹屬物種 (*Trogoderma* spp.)；

來自雙翅目，例如

伊蚊屬物種 (*Aedes* spp.)、瘧蚊屬物種 (*Anopheles* spp.)、高粱芒蚊 (*Antherigona soccata*)、橄欖果實蠅 (*Bactrocea oleae*)、花園毛蚊 (*Bibio hortulanus*)、遲眼蕈蚊屬物種 (*Bradysia* spp.)、紅頭麗蠅 (*Calliphora erythrocephala*)、小條實蠅屬物種 (*Ceratitis* spp.)、金蠅屬物種 (*Chrysomyia* spp.)、庫蚊屬物種 (*Culex* spp.)、黃蠅屬物種 (*Cuterebra* spp.)、寡鬚實蠅屬物種 (*Dacus* spp.)、地種蠅屬物種 (*Delia* spp.)、黑腹果蠅 (*Drosophilamelanogaster*)、廁蠅屬物種 (*Fannia* spp.)、胃蠅屬物種 (*Gastrophilus* spp.)、*Geomyza tripunctata*、舌蠅屬物種 (*Glossina* spp.)、皮蠅屬物種 (*Hypoderma* spp.)、虱蠅屬物種 (*Hyppobosca*

spp.)、斑潛蠅屬物種 (*Liriomyza* spp.)、綠蠅屬物種 (*Lucilia* spp.)、黑潛蠅屬物種 (*Melanagromyza* spp.)、家蠅屬物種 (*Musca* spp.)、狂蠅屬物種 (*Oestrus* spp.)、癭蚊屬物種 (*Orseolia* spp.)、瑞典麥稈蠅 (*Oscinella frit*)、藜泉蠅 (*Pegomyia hyoscyami*)、草種蠅屬物種 (*Phorbia* spp.)、繞實蠅屬物種 (*Rhagoletis* spp.)、*Rivelia quadrifasciata*、*Scatella*屬物種、尖眼蕈蚊屬物種 (*Sciara* spp.)、螫蠅屬物種 (*Stomoxys* spp.)、虻屬物種 (*Tabanus* spp.)、條蟲屬物種 (*Tannia* spp.) 以及大蚊屬物種 (*Tipula* spp.)；

來自半翅目，例如

瘤緣蝽 (*Acanthocoris scabrator*)、擬緣蝽屬物種 (*Acrosternum* spp.)、苜蓿盲蝽 (*Adelphocoris lineolatus*)、土黃緣蝽、海蝦盾緣蝽 (*Bathycoelia thalassina*)、土長蝽屬物種、臭蟲屬物種、*Clavigralla tomentosicollis*、盲蝽屬物種 (*Creontiades* spp.)、可可瘤盲蝽、*Dichelops furcatus*、棉紅蝽屬物種、埃德薩屬物種 (*Edessa* spp.)、美洲蝽屬物種 (*Euschistus* spp.)、六斑菜蝽 (*Eurydema pulchrum*)、扁盾蝽屬物種、茶翅蝽、具凹巨股長蝽 (*Horcias nobilellus*)、稻緣蝽屬物種、草盲蝽屬物種、熱帶碩蚧屬物種、捲心菜斑色蝽 (*Murgantia histrionic*)、新長緣蝽屬物種、煙盲蝽 (*Nesidiocoris tenuis*)、綠蝽屬物種、擬長蝽 (*Nysius simulans*)、海島蝽象、皮蝽屬物種、壁蝽屬物種、紅獵蝽屬物種、可可褐盲蝽、栗土蝽 (*Scaptocoris castanea*)、黑蝽屬物種 (*Scotinophara* spp.)、*Thyanta*屬物種、錐鼻蟲屬物種、木薯網蝽 (*Vatiga illudens*)；

豌豆無網長管蚜 (*Acyrtosium pisum*)、*Adalges*屬物種、*Agalliana ensigera*、塔爾吉隆脈木虱、粉虱屬物種 (*Aleurodicus* spp.)、刺粉虱屬物種 (*Aleurocanthus* spp.)、甘蔗穴粉虱、軟毛粉虱 (*Aleurothrixus floccosus*)、甘藍粉虱 (*Aleyrodes brassicae*)、棉葉蟬 (*Amarasca biguttula*)、椴果長突葉蟬、腎圓盾蚧屬物種、蚜科、蚜屬物種、圓盾蚧屬物種 (*Aspidiotus* spp.)、茄溝無網蚜、馬鈴薯/番茄木虱

(*Bactericera cockerelli*)、小粉虱屬物種、短尾蚜屬物種 (*Brachycaudus* spp.)、甘藍蚜、喀木虱屬物種、雙尾蚜 (*Cavariella aegopodii* Scop.)、蠟蚧屬物種、黑褐圓盾蚧、橙褐圓盾蚧、大葉蟬屬物種、大白葉蟬 (*Cofana spectra*)、隱瘤蚜屬物種、葉蟬屬物種、褐軟蚧、玉米黃翅葉蟬、裸粉虱屬物種、柑橘木虱、麥雙尾蚜、西圓尾蚜屬物種、小綠葉蟬屬物種、蘋果綿蚜、葡萄斑葉蟬屬物種、*Gascardia* 屬物種、赤桉木虱 (*Glycaspis brimblecombei*)、菜縊管蚜 (*Hyadaphis pseudobrassicae*)、大尾蚜屬物種 (*Hyalopterus* spp.)、超瘤蚜種 (*Hyperomyzus pallidus*)、椴果綠葉蟬 (*Idioscopus clypealis*)、非洲葉蟬、灰飛虱屬物種、水土堅蚧、蠟盾蚧屬物種、蘿蔔蚜 (*Lopaphis erysimi*)、*Lyogenys maidis*、長管蚜屬物種、沫蟬屬物種、蛾蠟蟬科 (*Metcalfa pruinosa*)、麥無網蚜、麥蠟蟬、瘤蚜屬物種、新聲蚜屬物種 (*Neotoxoptera* sp.)、黑尾葉蟬屬物種、褐飛虱屬物種 (*Nilaparvata* spp.)、梨大綠蚜、*Odonaspis ruthae*、甘蔗棉蚜、楊梅緣粉虱、考氏木虱、片盾蚧屬物種、癭綿蚜屬物種、玉米蠟蟬、扁角飛虱屬物種、忽布疣蚜、根瘤蚜屬物種 (*Phylloxera* spp.)、動性球菌屬物種、桑白盾蚧屬物種、粉蚧屬物種、棉跳盲蝽 (*Pseudatomoscelis seriatus*)、木虱屬物種、棉蚧 (*Pulvinaria aethiopica*)、齒盾蚧屬物種、*Quesada gigas*、電光葉蟬 (*Recilia dorsalis*)、縊管蚜屬物種、黑盔蚧屬物種、帶葉蟬屬物種、二叉蚜屬物種、麥蚜屬物種 (*Sitobion* spp.)、白背飛虱、三角苜蓿跳蟲 (*Spissistilus festinus*)、條斑飛虱 (*Tarophagus Proserpina*)、聲蚜屬物種、粉虱屬物種、*Tridiscus sporoboli*、葵粉蚧屬物種 (*Trionymus* spp.)、非洲木虱、矢尖蚧、火焰斑葉蟬、*Zyginidia scutellaris*；

來自膜翅目，例如

頂切葉蟻屬 (*Acromyrmex*)、三節葉蜂屬物種 (*Arge* spp.)、切葉蟻屬物種 (*Atta* spp.)、莖葉蜂屬物種 (*Cephus* spp.)、松葉蜂屬物種 (*Diprion* spp.)、鋸角葉蜂科 (*Diprionidae*)、松葉蜂 (*Gilpinia polytoma*)、實葉蜂屬物種 (*Hoplocampa*

spp.)、毛蟻屬物種 (*Lasius* spp.)、小黃家蟻 (*Monomorium pharaonis*)、新松葉蜂屬物種 (*Neodiprion* spp.)、農蟻屬物種 (*Pogonomyrmex* spp.)、紅火蟻、水蟻屬物種 (*Solenopsis* spp.) 以及胡蜂屬物種 (*Vespa* spp.)；

來自等翅目，例如

家白蟻屬物種 (*Coptotermes* spp.)、白蟻 (*Cornitermes cumulans*)、楹白蟻屬物種 (*Incisitermes* spp.)、大白蟻屬物種 (*Macrotermes* spp.)、澳白蟻屬物種 (*Mastotermes* spp.)、小白蟻屬物種 (*Microtermes* spp.)、散白蟻屬物種 (*Reticulitermes* spp.)；熱帶火蟻 (*Solenopsis geminate*)

來自鱗翅目 (*Lepidoptera*)，例如，

長翅卷蛾屬物種、褐帶卷蛾屬物種、透翅蛾屬物種、地夜蛾屬物種、棉葉蟲、*Amylois*屬物種、黎豆夜蛾、黃卷蛾屬物種、銀蛾屬物種 (*Argyresthia* spp.)、帶卷蛾屬物種、丫紋夜蛾屬物種、棉潛蛾、玉米楷夜蛾、粉斑螟蛾、桃蛀果蛾、禾草螟屬物種、色卷蛾屬物種、越蔓桔草螟 (*Chrysoteuchia topiaria*)、葡萄果蠹蛾、卷葉螟屬物種、雲卷蛾屬物種、紋卷蛾屬物種、鞘蛾屬物種、籬笆豆粉蝶 (*Colias lesbia*)、小造橋夜蛾 (*Cosmophila flava*)、草螟屬物種、大菜螟、蘋果異形小卷蛾、黃楊木蛾、小卷蛾屬物種、黃楊絹野螟、桿草螟屬物種、蘇丹棉鈴蟲、鑽夜蛾屬物種、甘薯桿螟、粉斑螟屬物種、葉小卷蛾屬物種 (*Epinotia* spp.)、鹽澤燈蛾 (*Estigmene acrea*)、*Etiella zinckinella*、花小卷蛾屬物種、環針單紋卷蛾、黃毒蛾屬物種、切根蟲屬物種、*Feltia jaculiferia*、小食心蟲屬物種 (*Grapholita* spp.)、雲霧廣翅小卷蛾、實夜蛾屬物種、菜螟、切葉野螟屬物種 (*Herpetogramma* spp.)、美國白蛾、番茄蠹蛾、*Lasmopalpus lignosellus*、旋紋潛葉蛾、潛葉細蛾屬物種、葡萄花翅小卷蛾、*Loxostege bifidalis*、毒蛾屬物種、潛蛾屬物種、幕枯葉蛾屬物種 (*Malacosoma* spp.)、甘藍夜蛾、煙草天蛾、光腹夜蛾屬物種 (*Mythimna* spp.)、夜蛾屬物種、秋尺蛾屬物種、*Orniodes indica*、歐洲玉米螟、超小卷蛾屬物種、

褐卷蛾屬物種、小眼夜蛾、蛀莖夜蛾、紅鈴麥蛾、咖啡潛葉蛾、一星黏蟲、馬鈴薯麥蛾、菜粉蝶、粉蝶屬物種、小菜蛾、小白巢蛾屬物種、尺葉蛾屬物種、薄荷灰夜蛾（*Rachiplusia nu*）、西方豆地香（*Richia albicosta*）、白禾螟屬物種（*Scirpophaga spp.*）、蛀莖夜蛾屬物種、長須卷蛾屬物種、灰翅夜蛾屬物種、棉大卷葉螟、興透翅蛾屬物種、異舟蛾屬物種、卷蛾屬物種、粉紋夜蛾、番茄斑潛蠅、以及巢蛾屬物種；

來自食毛目（*Mallophaga*），例如，

畜虱屬物種（*Damalinea spp.*）和鬃毛虱屬物種（*Trichodectes spp.*）；

來自直翅目（*Orthoptera*），例如，

蠊屬物種（*Blatta spp.*）、小蠊屬物種（*Blattella spp.*）、螻蛄屬物種（*Gryllotalpa spp.*）、馬德拉蜚蠊（*Leucophaea maderae*）、飛蝗屬物種（*Locusta spp.*）、北痣蟋蟀（*Neocurtilla hexadactyla*）、大蠊屬物種（*Periplaneta spp.*）、痣蟋蟀屬物種（*Scapteriscus spp.*）、以及沙漠蝗屬物種（*Schistocerca spp.*）；

來自齧蟲目（*Psocoptera*），例如，

虱齧屬物種（*Liposcelis spp.*）；

來自蚤目（*Siphonaptera*），例如，

角葉蚤屬物種（*Ceratophyllus spp.*）、櫛頭蚤屬物種（*Ctenocephalides spp.*）以及開皇客蚤（*Xenopsylla cheopis*）；

來自纓翅目（*Thysanoptera*），例如，

Calliothrips phaseoli、花薊馬屬物種（*Frankliniella spp.*）、陽薊馬屬物種（*Heliothrips spp.*）、褐帶薊馬屬物種（*Hercinothrips spp.*）、單親薊馬屬物種（*Parthenothrips spp.*）、非洲桔硬薊馬（*Scirtothrips aurantii*）、大豆薊馬（*Sericothrips variabilis*）、帶薊馬屬物種（*Taeniothrips spp.*）、薊馬屬物種（*Thrips spp.*）；

來自纓尾目（*Thysanura*），例如，衣魚（*Lepisma saccharina*）。

【0357】 根據本發明的活性成分可用於控制、即遏制或破壞上述類型的有害生物，該等有害生物特別出現在植物上，尤其是在農業中、在園藝中以及在林業中的有用的植物和觀賞植物上，或者在該等植物的器官上，例如果實、花、葉、莖、塊莖或根，並且在一些情況下，甚至在一個隨後的時間點形成的植物器官仍保持受保護以抵抗該等有害生物。

【0358】 特別地，適宜的目標作物係，穀物，如小麥、大麥、黑麥、燕麥、稻、玉米或高粱；甜菜，如糖用甜菜或飼料甜菜；水果，例如仁果、核果或無核小果，如蘋果、梨、李子、桃、杏、櫻桃或漿果，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、罌粟、橄欖、向日葵、椰子、蓖麻、可可豆或落花生；瓜類作物，如南瓜、黃瓜或甜瓜；纖維植物，如棉花、亞麻、大麻或黃麻；柑橘類水果，如柳橙、檸檬、葡萄柚或橘子；蔬菜，如菠菜、萵苣、蘆筍、捲心菜、胡蘿蔔、洋蔥、番茄、馬鈴薯或燈籠椒；樟科，如鱧梨、肉桂或樟腦；以及還有煙草、堅果、咖啡、茄子、甘蔗、茶、胡椒、葡萄藤、蛇麻草、車前草科以及乳膠植物。

【0359】 本發明的組成物和/或方法還可以用在任何觀賞植物和/或蔬菜作物（包括花、灌木、闊葉樹和常綠植物）上。

【0360】 例如，本發明可以用於任何以下觀賞植物物種：藿香薊屬物種、假面花屬物種 (*Alonsoa* spp.)、銀蓮花屬物種、南非葵 (*Anisodonteia capensis*)、春黃菊屬物種、金魚草屬物種、紫菀屬物種、秋海棠屬物種（例如麗格海棠、四季秋海棠、球根秋海棠 (*B. tubéreux*)）、葉子花屬物種、雁河菊屬物種 (*Brachycome* spp.)、芸苔屬物種（觀賞植物）、蒲包草屬物種、辣椒、長春花、美人蕉屬物種、矢車菊屬物種、菊屬物種、瓜葉菊屬物種（銀葉菊 (*C. maritime*)）、金雞菊屬物種、紅景天 (*Crassula coccinea*)、火紅萼距花 (*Cuphea ignea*)、大麗花屬物種、翠雀屬物種、荷包牡丹、彩虹菊屬物種 (*Dorotheantus* spp.)、洋桔梗、連翹屬物

種、倒掛金鐘屬物種、老鸛草屬鼠麴草屬 (*Geranium gnaphalium*)、大丁草屬物種、千日紅、天芥菜屬物種、向日葵屬物種、木槿屬物種、繡球花屬物種、繡球屬物種、嫣紅蔓、鳳仙花屬物種(非洲鳳仙花)、血苧屬物種 (*Iresines spp.*)、伽藍菜屬物種、馬纓丹、三月花葵、獅耳花、百合屬物種、松葉菊屬物種、溝酸漿屬物種、美國薄荷屬物種、龍面花屬物種、萬壽菊屬物種、石竹屬物種(康乃馨)、美人蕉屬物種、酢漿草屬物種、雛菊屬物種、天竺葵屬物種(盾葉天竺葵、馬蹄紋天竺葵)、堇菜屬物種(三色堇)、碧冬茄屬物種、草夾竹桃屬物種、香茶菜屬物種(*Plecthranthus spp.*)、一品紅屬物種、爬山虎屬物種(五葉爬山虎、爬山虎)、報春花屬物種、毛茛屬物種、杜鵑花屬物種、薔薇屬物種(玫瑰)、黃雛菊屬物種、非洲堇屬物種、鼠尾草屬物種、紫扇花(*Scaevola aemola*)、蛾蝶花(*Schizanthus wisetonensis*)、景天屬物種、茄屬物種、蘇非尼亞矮牽牛屬物種 (*Surfinia spp.*)、萬壽菊屬物種、煙草屬物種、馬鞭草屬物種、百日草屬物種以及其他花壇植物。

【0361】 例如，本發明可以用於任何以下蔬菜物種：蔥屬物種(大蒜、洋蔥、*A. oschaninii*、韭蔥、火蔥、大蔥)、茴香芹、旱芹 (*Apium graveolus*)、蘆筍、甜菜 (*Beta vulgaris*)、芸苔屬物種(甘藍、大白菜、蕪菁)、辣椒、鷹嘴豆、苦苣、菊苣屬物種(菊苣、苦苣)、西瓜、黃瓜屬物種(黃瓜、甜瓜)、南瓜屬物種(西葫蘆、印度南瓜)、菜薊屬物種 (*Cyanara spp.*) (朝鮮薊、刺苞菜薊)、野胡蘿蔔、茴香、金絲桃屬物種、萵苣、番茄屬物種(番茄、聖女果番茄)、薄荷屬物種、羅勒、香芹、菜豆屬物種(菜豆、荷包豆)、豌豆、蘿蔔、食用大黃、迷迭香屬物種、鼠尾草屬物種、黑婆羅門參 (*Scorzonera hispanica*)、茄子、菠菜、新纈草屬物種(萵苣纈草、*V. eriocarpa*) 以及蠶豆。

【0362】 較佳的觀賞植物物種包括非洲堇 (African violet)、秋海棠屬、大麗花屬、大丁草屬、繡球屬、馬鞭草屬、薔薇屬、伽藍菜屬、一品紅屬、紫菀屬、矢車菊屬、金雞菊屬、翠雀屬、美國薄荷屬、草夾竹桃屬、黃雛菊屬、景天屬、

碧冬茄屬、莖菜屬、鳳仙花屬、老鸛草屬、菊屬、毛茛屬、倒掛金鐘屬、鼠尾草屬、繡球花屬、迷迭香、鼠尾草、聖約翰草 (St. Johnswort)、薄荷 (mint)、甜椒 (sweet pepper)、番茄和黃瓜 (cucumber)。

【0363】 根據本發明的該等活性成分尤其適合於控制棉花、蔬菜、玉米、水稻以及大豆作物上的扁豆蚜、黃瓜條葉甲、煙芽夜蛾、桃蚜、小菜蛾以及海灰翅夜蛾。根據本發明的該等活性成分另外尤其適合於控制甘藍夜蛾(較佳的是在蔬菜上)、蘋果蠹蛾(較佳的是在蘋果上)、小綠葉蟬(較佳的是在蔬菜、葡萄園裡)、馬鈴薯葉甲 (*Leptinotarsa*) (較佳的是在馬鈴薯上) 以及二化螟(較佳的是在水稻上)。

【0364】 根據本發明的該等活性成分尤其適合於控制棉花、蔬菜、玉米、水稻以及大豆作物上的扁豆蚜、黃瓜條葉甲、煙芽夜蛾、桃蚜、小菜蛾以及海灰翅夜蛾。根據本發明的該等活性成分另外尤其適合於控制甘藍夜蛾(較佳的是在蔬菜上)、蘋果蠹蛾(較佳的是在蘋果上)、小綠葉蟬(較佳的是在蔬菜、葡萄園裡)、馬鈴薯葉甲 (*Leptinotarsa*) (較佳的是在馬鈴薯上) 以及二化螟(較佳的是在水稻上)。

【0365】 在另一方面中，本發明還可關於一種控制由植物寄生線蟲(內寄生的-、半內寄生的-和外寄生線蟲) 對植物及其部分的損害之方法，尤其是以下植物寄生線蟲，如根結線蟲 (root knot nematodes)、北方根結線蟲 (*Meloidogyne hapla*)、南方根結線蟲 (*Meloidogyne incognita*)、爪哇根結線蟲 (*Meloidogyne javanica*)、花生根結線蟲 (*Meloidogyne arenaria*) 以及其他根結線蟲物種；孢囊形成線蟲 (cyst-forming nematodes)、馬鈴薯金線蟲 (*Globodera rostochiensis*) 以及其他球孢囊線蟲屬 (*Globodera*) 物種；禾穀孢囊線蟲 (*Heterodera avenae*)、大豆孢囊線蟲 (*Heterodera glycines*)、甜菜孢囊線蟲 (*Heterodera schachtii*)、紅三葉異皮線蟲 (*Heterodera trifolii*)、以及其他異皮線蟲屬 (*Heterodera*) 物種；種癭

線蟲 (Seed gall nematodes)、粒線蟲屬 (Anguina) 物種；莖及葉面線蟲 (Stem and foliar nematodes)、滑刃線蟲屬 (Aphelenchoides) 物種；刺毛線蟲 (Sting nematodes)、長尾刺線蟲 (Belonolaimus longicaudatus) 以及其他刺線蟲屬 (Belonolaimus) 物種；松樹線蟲 (Pine nematodes)、松材線蟲 (Bursaphelenchus xylophilus) 以及其他傘滑刃屬 (Bursaphelenchus) 物種；環形線蟲 (Ring nematodes)、環線蟲屬 (Criconema) 物種、小環線蟲屬 (Criconemella) 物種、輪線蟲屬 (Criconemoides) 物種、中環線蟲屬 (Mesocriconema) 物種；莖及鱗球莖線蟲 (Stem and bulb nematodes)、腐爛莖線蟲 (Ditylenchus destructor)、鱗球莖莖線蟲 (Ditylenchus dipsaci) 以及其他莖線蟲屬 (Ditylenchus) 物種；維線蟲 (Awl nematodes)、錐線蟲屬 (Dolichodorus) 物種；螺旋線蟲 (Spiral nematodes)、多頭螺旋線蟲 (Helicotylenchus multicinctus) 以及其他螺旋線蟲屬 (Helicotylenchus) 物種；鞘及鞘形線蟲 (Sheath and sheathoid nematodes)、鞘線蟲屬 (Hemicycliophora) 物種以及半輪線蟲屬 (Hemicriconemoides) 物種；潛根線蟲屬 (Hirshmanniella) 物種；支線蟲 (Lance nematodes)、冠線蟲屬 (Hoploaimus) 物種；假根結線蟲 (false rootknot nematodes)、珍珠線蟲屬 (Nacobbus) 物種；針狀線蟲 (Needle nematodes)、橫帶長針線蟲 (Longidorus elongatus) 以及其他長針線蟲屬 (Longidorus) 物種；大頭針線蟲 (Pin nematodes)、短體線蟲屬 (Pratylenchus) 物種；腐線蟲 (Lesion nematodes)、花斑短體線蟲 (Pratylenchus neglectus)、穿刺短體線蟲 (Pratylenchus penetrans)、彎曲短體線蟲 (Pratylenchus curvatus)、古氏短體線蟲 (Pratylenchus goodeyi) 以及其他短體線蟲屬物種；柑桔穿孔線蟲 (Burrowing nematodes)、香蕉穿孔線蟲 (Radopholus similis) 以及其他內侵線蟲屬 (Radopholus) 物種；腎狀線蟲 (Reniform nematodes)、羅柏氏盤旋線蟲 (Rotylenchus robustus)、腎形盤旋線蟲 (Rotylenchus reniformis) 以及其他盤旋線蟲屬 (Rotylenchus) 物種；盾線蟲屬 (Scutellonema) 物種；短粗根線

蟲 (Stubby root nematodes)、原始毛刺線蟲 (Trichodorus primitivus) 以及其他毛刺線蟲屬 (Trichodorus) 物種、擬毛刺線蟲屬 (Paratrichodorus) 物種；矮化線蟲 (Stunt nematodes)、馬齒莧矮化線蟲 (Tylenchorhynchus claytoni)、順逆矮化線蟲 (Tylenchorhynchus dubius) 以及其他矮化線蟲屬 (Tylenchorhynchus) 物種；柑桔線蟲 (Citrus nematodes)、穿刺線蟲 (Tylenchulus) 物種；短劍線蟲 (Dagger nematodes)、劍線蟲屬 (Xiphinema) 物種；以及其他植物寄生線蟲物種，如亞粒線蟲屬物種 (Subanguina spp.)、根結線蟲屬物種 (Hypsoperine spp.)、大刺環線蟲屬物種 (Macroposthonia spp.)、矮化線蟲屬物種 (Melinius spp.)、刻點胞囊屬物種 (Punctodera spp.)、以及五溝線蟲屬物種 (Quinisulcius spp.)。

【0366】 本發明的化合物還具有針對軟體動物的活性。其實例包括例如福壽螺科；蛞蝓科 (Arion) (黑蛞蝓 (A. ater)、環狀蛞蝓 (A. circumscriptus)、棕阿勇蛞蝓 (A. hortensis)、紅蛞蝓 (A. rufus))；巴蝸牛科 (Bradybaenidae) (灌木巴蝸牛 (Bradybaena fruticum))；蔥蝸牛屬 (Cepaea) (花園蔥蝸牛 (C. hortensis)、森林蔥蝸牛 (C. Nemoralis))；ochlodina；野蛞蝓屬 (Deroceras) (野灰蛞蝓 (D. agrestis)、D. empiricorum、光滑野蛞蝓 (D. laeve)、網紋野蛞蝓 (D. reticulatum))；圓盤螺屬 (Discus) (圓形圓盤蝸牛 (D. rotundatus))；Euomphalia；土蝸屬 (Galba) (截口土蝸 (G. trunculata))；小蝸牛屬 (Helicella) (伊塔拉小蝸牛 (H. itala)、布維小蝸牛 (H. obvia))；大蝸牛科 (Helicidae) Helicigona arbustorum)；Helicodiscus；大蝸牛 (Helix) (開口大蝸牛 (H. aperta))；蛞蝓屬 (Limax) (利邁科斯蛞蝓 (L. cinereoniger)、黃蛞蝓 (L. flavus)、邊緣蛞蝓 (L. marginatus)、大蛞蝓 (L. maximus)、柔蛞蝓 (L. tenellus))；椎實螺屬 (Lymnaea)；Milax (小蛞蝓科) (黑色小蛞蝓 (M. gagates)、邊緣小蛞蝓 (M. marginatus)、碩氏小蛞蝓 (M. sowerbyi))；鑽螺屬 (Opeas)；瓶螺屬 (Pomacea) (福壽螺 (P. canaticulata))；瓦婁蝸牛屬 (Vallonia) 和 Zanitoides。

【0367】 術語「作物」應當理解為還包括已經藉由使用重組DNA技術而被這樣轉形使其能夠合成一種或多種選擇性作用毒素的作物植物，該等毒素係如已知例如來自於產毒素細菌，尤其是芽孢桿菌屬的那些細菌。

【0368】 可由此類轉基因植物表現的毒素包括例如殺昆蟲蛋白，例如來自蠟樣芽孢桿菌或日本金龜子芽孢桿菌的殺昆蟲蛋白；或者來自蘇雲金芽孢桿菌的殺昆蟲蛋白，如 δ -內毒素，例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C，或者營養期殺昆蟲蛋白（Vip），例如Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A；或線蟲寄生性細菌（例如光桿狀菌屬物種（*Photorhabdus* spp.）或致病桿菌屬物種（*Xenorhabdus* spp.），諸如發光桿菌（*Photorhabdus luminescens*）、嗜線蟲致病桿菌（*Xenorhabdus nematophilus*））的殺昆蟲蛋白；由動物產生的毒素，諸如蠍毒素、蛛毒素、蜂毒素和其他昆蟲特異性神經毒素；由真菌產生的毒素，如鏈黴菌毒素，植物凝集素類（lectin），如豌豆凝集素、大麥凝集素或雪花蓮凝集素；凝集素（agglutinin）；蛋白酶抑制劑，諸如胰蛋白酶抑制劑、絲胺酸蛋白酶抑制劑、馬鈴薯糖蛋白、朊抑素、木瓜蛋白酶抑制劑；核糖體失活蛋白（RIP），諸如蓖麻毒素、玉蜀黍-RIP、相思豆毒素、絲瓜籽毒蛋白、皂草毒素蛋白或異株瀉根毒蛋白；類固醇代謝酶，如3-羥基類固醇氧化酶、蛻化類固醇-UDP-糖基-轉移酶、膽固醇氧化酶、蛻化素抑制劑、HMG-COA-還原酶、離子通道阻斷劑諸如鈉通道或鈣通道阻斷劑、保幼激素酯酶、利尿激素受體、芪合酶、聯苜合酶、幾丁質酶和葡聚糖酶。

【0369】 在本發明的背景下， δ -內毒素（例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C）或營養期殺蟲蛋白（Vip）（例如Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A）應理解為顯然還包括混合型毒素、截短的毒素和經修飾的毒素。混合型毒素係藉由那些蛋白的不同結構域的新組合重組產生的（參見例如，WO 02/15701）。截短的毒素，例如截短的Cry1Ab係已知的。在經修飾

的毒素的情況下，天然存在的毒素的一個或多個胺基酸被置換。在這種胺基酸置換中，較佳的是將非天然存在的蛋白酶識別序列插入毒素中，例如像在Cry3A055的情況下，一種組織蛋白酶-G-識別序列被插入Cry3A毒素中（參見WO 03/018810）。

【0370】 此類毒素或能夠合成此類毒素的轉基因植物的實例揭露於例如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。

【0371】 用於製備這樣的轉基因植物之方法通常是熟悉該項技術者已知的並且描述在例如以上提及的公開物中。CryI型去氧核糖核酸及其製備例如從WO 95/34656、EP-A-0 367 474、EP-A-0 401 979和WO 90/13651中已知。

【0372】 包括在轉基因植物中的毒素使得植物對有害昆蟲有耐受性。這樣的昆蟲可以存在於任何昆蟲分類群，但尤其常見於甲蟲（鞘翅目）、雙翅昆蟲（雙翅目）和蛾（鱗翅目）。

【0373】 包含一種或多種編碼殺昆蟲劑抗性並且表現一種或多種毒素的基因的轉基因植物係已知的並且其中一些係可商購的。此類植物的實例係：YieldGard®（玉米品種，表現Cry1Ab毒素）；YieldGard Rootworm®（玉米品種，表現Cry3Bb1毒素）；YieldGard Plus®（玉米品種，表現Cry1Ab和Cry3Bb1毒素）；Starlink®（玉米品種，表現Cry9C毒素）；Herculex I®（玉米品種，表現Cry1Fa2毒素和獲得對除草劑草銨磷銨鹽耐藥性的酶磷絲菌素N-乙醯基轉移酶（PAT））；NuCOTN 33B®（棉花品種，表現Cry1Ac毒素）；Bollgard I®（棉花品種，表現Cry1Ac毒素）；Bollgard II®（棉花品種，表現Cry1Ac和Cry2Ab毒素）；VipCot®（棉花品種，表現Vip3A和Cry1Ab毒素）；NewLeaf®（馬鈴薯品種，表現Cry3A毒素）；NatureGard®、Agrisure® GT Advantage（GA21耐草甘膦性狀）、Agrisure® CB Advantage（Bt11玉米螟（CB）性狀）以及Protecta®。

【0374】 此類轉基因作物的另外的實例係：

1. **Bt11**玉米，來自先正達種子公司(Syngenta Seeds SAS)，霍比特路(Chemin de l'Hobit) 27，F-31 790聖蘇維爾 (St. Sauveur)，法國，登記號C/FR/96/05/10。遺傳修飾的玉蜀黍，藉由轉基因表現截短的Cry1Ab毒素，使之能抵抗歐洲玉米螟（玉米螟和粉莖螟）的侵襲。**Bt11**玉米還轉基因表現PAT酶以獲得對除草劑草銨磷銨鹽的耐受性。

2. **Bt176**玉米，來自先正達種子公司，霍比特路27，F-31 790聖蘇維爾，法國，登記號C/FR/96/05/10。遺傳修飾的玉蜀黍，藉由轉基因表現Cry1Ab毒素，使之能抵抗歐洲玉米螟（玉米螟和粉莖螟）的侵襲。**Bt176**玉米還轉基因表現酶PAT以獲得對除草劑草銨磷銨鹽的耐受性。

3. **MIR604**玉米，來自先正達種子公司，霍比特路27, F-31 790聖蘇維爾，法國，登記號C/FR/96/05/10。藉由轉基因表現經修飾的Cry3A毒素使之具有昆蟲抗性的玉米。此毒素係藉由插入組織蛋白酶-G-蛋白酶識別序列而經修飾的Cry3A055。此類轉基因玉米植物的製備描述於WO 03/018810中。

4. **MON 863**玉米，來自孟山都歐洲公司 (Monsanto Europe S.A.)，270-272特弗倫大道(Avenue de Tervuren)，B-1150 布魯塞爾，比利時，登記號C/DE/02/9。**MON 863**表現Cry3Bb1毒素，並且對某些鞘翅目昆蟲有抗性。

5. **IPC 531**棉花，來自孟山都歐洲公司，270-272特弗倫大道，B-1150 布魯塞爾，比利時，登記號C/ES/96/02。

6. **1507**玉米，來自先鋒海外公司 (Pioneer Overseas Corporation)，特德斯科大道 (Avenue Tedesco)，7 B-1160 布魯塞爾，比利時，登記號C/NL/00/10。遺傳修飾的玉米，表現蛋白質Cry1F以獲得對某些鱗翅目昆蟲的抗性，並且表現PAT蛋白質以獲得對除草劑草銨磷銨的耐受性。

7. **NK603 × MON 810**玉米，來自孟山都歐洲公司270-272特弗倫大道，B-

1150布魯塞爾，比利時，登記號C/GB/02/M3/03。藉由將遺傳修飾的品種NK603和MON 810雜交，由常規育種的雜交玉米品種構成。NK603 × MON 810玉米轉基因地表現由土壤桿菌屬菌株CP4獲得的蛋白質CP4 EPSPS，使之耐除草劑Roundup®（含有草甘膦），以及還有由蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克亞種獲得的Cry1Ab毒素，使之耐某些鱗翅目昆蟲，包括歐洲玉米螟。

【0375】 抗昆蟲的植物的轉基因作物還描述於BATS（生物安全與可持續發展中心（Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit），BATS中心（Zentrum BATS），克拉斯崔舍（Clarastrasse）13，巴塞爾（Basel）4058，瑞士）報告2003（<http://bats.ch>）中。

【0376】 術語「作物」應理解為還包括已經藉由使用重組DNA技術而被這樣轉形使其能夠合成具有選擇性作用的抗病原物質的作物植物，該等抗病原物質係例如像所謂的「病程相關蛋白」（PRP，參見例如EP-A-0 392 225）。此類抗病原物質和能夠合成此類抗病原物質的轉基因植物的實例例如從EP-A-0 392 225、WO 95/33818和EP-A-0 353 191係已知的。生產此類轉基因植物之方法對於熟悉該項技術者而言通常是已知的並且描述於例如以上提及的公開物中。

【0377】 作物也可以經修飾以增加對真菌（例如鐮孢黴屬、炭疽病或疫黴屬）、細菌（例如假單胞菌屬）或病毒（例如馬鈴薯卷葉病毒、番茄斑萎病毒、黃瓜花葉病毒）病原體的抗性。

【0378】 作物還包括對線蟲（如大豆異皮線蟲）具有增加的抗性的那些作物。

【0379】 具有對非生物性脅迫的耐受性的作物包括例如藉由NF-YB或本領域中已知的其他蛋白質的表現對乾旱、高鹽、高溫、寒冷、霜或光輻射具有增加的耐受性的那些作物。

【0380】 可由此類轉基因植物表現的抗病原物質包括例如離子通道阻斷

劑，如鈉通道和鈣通道的阻斷劑，例如病毒KP1、KP4或KP6毒素；萘合酶；聯苯合酶；幾丁質酶；葡聚糖酶；所謂「病程相關蛋白」(PRP；參見例如EP-A-0 392 225)；由微生物產生的抗病原物質，例如肽抗生素或雜環抗生素(參見例如WO 95/33818)或參與植物病原體防禦的蛋白質或多肽因子(所謂「植物疾病抗性基因」，如WO 03/000906中所述)。

【0381】 根據本發明的組成物的其他使用範圍係保護所儲存的物品和儲存室以及保護原材料，如木材、紡織品、地板或建築物，以及還在衛生領域中，尤其是保護人類、家畜以及多產的牲畜免遭所提及類型的有害生物的危害。

【0382】 本發明還提供了用於控制有害生物(如蚊和其他的疾病媒介物；同樣參見http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/)之方法。在一個實施方式中，用於控制有害生物之方法包括藉由塗刷、輥塗、噴霧、塗布或浸漬，向目標有害生物、它們的場所或表面或基底施用本發明的組成物。藉由舉例，藉由本發明之方法考慮到了表面(如牆、天花板或地板表面)的IRS(室內滯留噴霧)施用。在另一個實施方式中，考慮到了將此類組成物施用於如下基底，如無紡或織物材料，該材料處於網織品、被覆物、被褥、窗簾以及帳篷的形式(或可以用於在該等物品的製造中使用)。

【0383】 在一個實施方式中，用於控制此類有害生物之方法包括向目標有害生物、它們的場所或表面或基底施用殺有害生物有效量的本發明的組成物，以便於在該表面或基底上提供有效的滯留的殺有害生物活性。這樣的施用可以藉由塗刷、輥塗、噴霧、塗布或浸漬本發明的殺有害生物組成物來進行。藉由舉例，藉由本發明之方法考慮到了表面(如牆、天花板或地板表面)的IRS施用，以便於在該表面上提供有效的滯留的殺有害生物活性。在另一個實施方式中，考慮了施用此類組成物以用於在基底上的有害生物的殘留控制，該基底係如處於網織品、被覆物、被褥、窗簾以及帳篷的形式(或可以用於在該等物品的製造中)的

織物材料。

【0384】 有待處理的基底(包括無紡物、織物或網織品)可以由天然纖維，如棉花、拉菲亞樹葉纖維、黃麻、亞麻、劍麻、粗麻布或羊毛，或者合成纖維，如聚醯胺、聚酯、聚丙烯、聚丙烯腈等等製成。聚酯係特別適合的。紡織品處理之方法係已知的，例如WO 2008/151984、WO 2003/034823、US 5631072、WO 2005/64072、WO 2006/128870、EP 1724392、WO 2005113886或WO 2007/090739。

【0385】 根據本發明的組成物的其他使用範圍係針對所有觀賞樹木連同所有種類的果樹和堅果樹的樹木注射/樹幹處理領域。

【0386】 在樹木注射/樹幹處理領域中，根據本發明的化合物尤其適合於對抗來自如上提及的鱗翅目和來自鞘翅目的蛀木昆蟲，尤其是對抗下表A和B中列出的蛀木蟲：

[表A].具有經濟重要性的外來蛀木蟲的實例。

科	種	受侵染的宿主或作物
吉丁蟲科	白蠟窄吉丁	白蠟木 (Ash)
天牛科	光肩天牛	硬木
小蠹科	粗穗賴草足距小蠹 (<i>Xylosandrus crassiusculus</i>)	硬木
	削尾材小蠹	硬木
	縱坑切梢小蠹	松柏類植物

[表B].具有經濟重要性的本地蛀木蟲的實例。

科	種	受侵染的宿主或作物
吉丁蟲科	樺銅窄吉丁 (<i>Agrilus anxius</i>)	樺樹
	磨光窄吉丁 (<i>Agrilus politus</i>)	柳樹、楓樹
	<i>Agrilus sayi</i>	楊梅、香蕨木
	<i>Agrilus vittaticollis</i>	蘋果樹、梨樹、蔓越橘、唐棣、山楂樹
	蘋扁頭吉丁 (<i>Chrysobothris femorata</i>)	蘋果、杏、山毛櫸、白蠟槭、櫻桃樹、栗樹、紅醋栗樹、榆樹、山楂樹、樸樹、山核桃樹、歐洲七葉樹、菩提樹、楓樹、歐洲花

科	種	受侵染的宿主或作物
		楸樹、橡樹、美洲山核桃樹、梨樹、桃樹、柿子樹、李子樹、楊樹、椴樹、美國紫荊、唐棣、美國梧桐、核桃樹、柳樹
	<i>Texania campestris</i>	椴木、山毛櫸、楓樹、橡樹、美國梧桐、柳樹、黃楊
天牛科	對山毛櫸天牛 (<i>Goes pulverulentus</i>)	山毛櫸、榆樹、納托爾 (Nuttall)、柳樹、黑橡樹、櫻皮鑷狀櫟、黑櫟、美國梧桐
	虎橡天牛 (<i>Goes tigrinus</i>)	橡樹
	黑腹尼虎天牛 (<i>Neoclytus acuminatus</i>)	白蠟木、山核桃樹、橡樹、核桃樹、樺樹、山毛櫸、楓樹、美洲鐵木 (Eastern hophornbeam)、山茱萸、柿子樹、美國紫荊、冬青、樸樹、洋槐、美國皂莢木 (Honeylocust)、黃楊、栗樹、奧塞奇橙木 (Osage-orange)、黃樟、紫丁香、短葉紫杉 (Mountain-mahogany)、梨樹、櫻桃樹、李子樹、桃樹、蘋果樹、榆樹、菩提樹、楓香
	三線無花果天牛 (<i>Neoptychodes trilineatus</i>)	無花果樹、赤楊木、桑樹、柳樹、網葉樸樹 (Netleaf hackberry)
	灰翅筒天牛 (<i>Oberea ocellata</i>)	漆樹、蘋果樹、桃樹、李子樹、梨樹、紅醋栗樹、黑莓
	三點筒天牛 (<i>Oberea tripunctata</i>)	山茱萸、莢蒾屬、榆樹、酸模樹、藍莓、杜鵑花屬、杜鵑、月桂樹、楊樹、柳樹、桑樹
	繞枝溝脛天牛 (<i>Oncideres cingulata</i>)	山核桃樹、美洲山核桃樹、柿子樹、榆樹、酸模樹、菩提樹、美國皂莢木、山茱萸、桉樹、橡樹、樸樹、楓樹、果樹
	對楊黃斑楔天牛 (<i>Saperda calcarata</i>)	楊樹
<i>Strophiona nitens</i>	栗樹、橡樹、山核桃樹、核桃樹、山毛櫸、楓樹	

科	種	受侵染的宿主或作物
小蠹科	<i>Corthylus columbianus</i>	楓樹、橡樹、黃楊、山毛櫸、白蠟槭、美國梧桐、樺樹、菩提樹、栗樹、榆樹
	南方松大小蠹 (<i>Dendroctonus frontalis</i>)	松樹
	美樺毛小蠹 (<i>Dryocoetes betulae</i>)	樺樹、楓香、野櫻桃樹、山毛櫸、梨樹
	黃帶芳小蠹 (<i>Monarthrum fasciatum</i>)	橡樹、楓樹、樺樹、栗樹、楓香、藍果木、楊樹、山核桃樹、含羞草、蘋果樹、桃樹、松樹
	桃總角小蠹 (<i>Phloeotribus liminaris</i>)	桃樹、櫻桃樹、李子樹、黑櫻桃樹、榆樹、桑樹、歐洲花楸樹
	<i>Pseudopityophthorus pruinus</i>	橡樹、美國山毛櫸木、黑櫻桃樹、契卡索李子樹 (<i>Chickasaw plum</i>)、栗樹、楓樹、山核桃樹、角樹、鐵木
透翅蛾科	棟透翅蛾 (<i>Paranthrene simulans</i>)	橡樹、美洲栗樹
	<i>Sannina uroceriformis</i>	柿子樹
	小桃翅蛾	桃樹、李子樹、油桃樹、櫻桃樹、杏樹、扁桃樹、黑櫻桃樹
	李桃翅蛾 (<i>Synanthedon pictipes</i>)	桃樹、李子樹、櫻桃樹、山毛櫸、黑櫻桃樹
	<i>Synanthedon rubrofascia</i>	藍果樹
	<i>Synanthedon scitula</i>	山茱萸、美洲山核桃、山核桃樹、橡樹、栗樹、山毛櫸、樺樹、黑櫻桃樹、榆樹、歐洲花楸樹、莢蒾屬、柳樹、蘋果樹、枇杷樹、九層皮、楊梅
	葡萄根透翅蛾 (<i>Vitacea polistiformis</i>)	葡萄樹

【0387】 本發明還可以用於控制任何可以存在於草坪草中的昆蟲有害生物包括例如甲蟲、毛蟲、火蟻、地面珍珠 (ground pearl)、千足蟲、潮蟲、蠕蟲、螻蛄、介殼蟲、粉蚧、蜉、沫蟬、南方麥小蝻以及鱗蝨。本發明可以用於控制處於其生命週期的各個階段的昆蟲有害生物，包括卵、幼蟲、若蟲和成蟲。

【0388】 具體而言，本發明可用於控制取食草坪草的根部的昆蟲有害生物，該昆蟲有害生物包括蟻螞（諸如圓頭犀金龜屬物種（*Cyclocephala spp.*）（例如標記的金龜子、*C. lurida*）、*Rhizotrogus*屬物種（例如歐洲金龜子，歐洲切根金龜（*R. majalis*））、黃櫨屬物種（*Cotinus spp.*）（例如綠六月甲蟲（Green June beetle）、綠六月花金龜（*C. nitida*））、弧麗金龜屬物種（*Popillia spp.*）（例如日本甲蟲、日本弧麗金龜（*P. japonica*））、鰓角金龜屬物種（*Phyllophaga spp.*）（例如五月/六月甲蟲）、金龜屬物種（例如草坪草黑金龜（Black turfgrass atenius）、黑絨金龜）、絨毛金龜屬物種（*Maladera spp.*）（例如亞洲花園甲蟲（Asiatic garden beetle）、栗色絨金龜）以及*Tomarus*屬物種）、地面珍珠（碩蚧屬物種（*Margarodes spp.*））、螻蛄（褐黃色的、南方的、以及短翅的；痣蟋蟀屬物種（*Scapteriscus spp.*）、非洲螻蛄（*Grylotalpa africana*））以及大蚊幼蟲（leatherjackets）（歐洲大蚊（European crane fly）、大蚊屬物種（*Tipula spp.*））。

【0389】 本發明還可以用於控制棲於蓋屋頂用茅草的草坪草的昆蟲有害生物，該等昆蟲有害生物包括黏蟲（諸如秋夜蛾（fall armyworm）草地貪夜蛾（*Spodoptera frugiperda*），和常見黏蟲一星黏蟲（*Pseudaletia unipuncta*））、切根蟲，象鼻蟲（尖隱喙象屬物種（*Sphenophorus spp.*），諸如*S. venatus verstitus*和牧草長喙象（*S. parvulus*））以及草地螟（如草螟屬物種（*Crambus spp.*）和熱帶草地螟，*Herpetogramma phaeopteralis*）。

【0390】 本發明還可以用於控制在地上生活並取食草坪草葉子的草坪草中的昆蟲有害生物，該等昆蟲有害生物包括麥小蝻（諸如南方麥小蝻，南方桿長蝻（*Blissus insularis*））、狗牙根蟻（Bermudagrass mite）（*Eriophyes cynodoniensis*）、蓋氏虎尾草粉蚧（草竹粉蚧（*Antonina graminis*））、兩線沫蟬（*Prospapia bicincta*）、葉蟬、切根蟲（夜蛾科）、以及麥二叉蚧。

【0391】 本發明還可以用於控制草坪草中的其他有害生物，諸如在草坪中

創建蟻巢的外引紅火蟻（紅火蟻（*Solenopsis invicta*））。

【0392】 在衛生領域中，根據本發明的組成物有效地對抗外寄生蟲如硬蜱、軟蜱、疥蟎、秋蟎、蠅（叮咬和舔舐）、寄生性蠅幼蟲，虱、髮虱、烏虱和跳蚤。

【0393】 此類寄生蟲的實例係：

【0394】 虱目：血虱屬物種、長顎虱屬物種（*Linognathus spp.*）、人虱屬物種以及陰虱屬物種（*Phthirus spp.*）、管虱屬物種。

【0395】 食毛目：毛羽虱屬物種、短羽虱屬物種、鴨虱屬物種、牛羽虱屬物種、*Werneckiella*屬物種、*Lepikentron*屬物種、畜虱屬物種、鬃毛虱屬物種以及貓羽虱屬物種（*Felicola spp.*）。

【0396】 雙翅目及長角亞目（*Nematocera*）和短角亞目（*Brachycera*），例如伊蚊屬物種（*Aedes spp.*）、瘧蚊屬物種、庫蚊屬物種（*Culex spp.*）、蚋屬物種（*Simulium spp.*）、真蚋屬物種（*Eusimulium spp.*）、白蛉屬物種（*Phlebotomus spp.*）、羅蛉屬物種（*Lutzomyia spp.*）、庫蠅屬物種（*Culicoides spp.*）、斑虻屬物種（*Chrysops spp.*）、駝背虻屬物種（*Hybomitra spp.*）、黃虻屬物種（*Atylotus spp.*）、虻屬物種（*Tabanus spp.*）、麻虻屬物種（*Haematopota spp.*）、*Philipomyia*屬物種、蜂虱蠅屬物種（*Braula spp.*）、家蠅屬物種（*Musca spp.*）、齒股蠅屬物種（*Hydrotaea spp.*）、螻蠅屬物種、黑角蠅屬物種（*Haematobia spp.*）、莫蠅屬物種（*Morellia spp.*）、廁蠅屬物種（*Fannia spp.*）、舌蠅屬物種（*Glossina spp.*）、麗蠅屬物種（*Calliphora spp.*）、綠蠅屬物種（*Lucilia spp.*）、金蠅屬物種（*Chrysomyia spp.*）、汗蠅屬物種（*Wohlfahrtia spp.*）、麻蠅屬物種（*Sarcophaga spp.*）、狂蠅屬物種（*Oestrus spp.*）、皮蠅屬物種（*Hypoderma spp.*）、胃蠅屬物種（*Gasterophilus spp.*）、虱蠅屬物種（*Hippobosca spp.*）、羊虱蠅屬物種（*Lipoptena spp.*）和蜱蠅屬物種（*Melophagus spp.*）。

【0397】 蚤目 (Siphonapterida)，例如蚤屬物種 (Pulex spp.)、櫛頭蚤屬物種、客蚤屬物種 (Xenopsylla spp.)、角葉蚤屬物種。

【0398】 異翅目 (Heteroptera)，例如臭蟲屬物種、錐鼻蟲屬物種、紅獵蝽屬物種、錐蝽屬物種 (Panstrongylus spp.)。

【0399】 蜚蠊目 (Blattaria)，例如東方蜚蠊 (Blatta orientalis)、美洲大蠊 (Periplaneta americana)、德國小蠊 (Blattella germanica) 以及夏柏拉蟑螂屬物種 (Supella spp.)。

【0400】 蜱蟎 (Acaria) 亞綱 (蟎科 (Acarida)) 和後氣門目 (Meta-stigmata) 和中氣門目 (Meso-stigmata)，例如銳緣蜱屬物種 (Argas spp.)、鈍緣蜱屬物種 (Ornithodoros spp.)、耳蜱屬物種 (Otobius spp.)、硬蜱屬物種 (Ixodes spp.)、鈍眼蜱屬物種 (Amblyomma spp.)、牛蜱屬物種 (Boophilus spp.)、革蜱屬物種 (Dermacentor spp.)、血蜱屬物種 (Haemophysalis spp.)、璃眼蜱屬物種 (Hyalomma spp.)、扇頭蜱屬物種 (Rhipicephalus spp.)、皮刺蟎屬物種 (Dermanyssus spp.)、刺利蟎屬物種 (Raillietia spp.)、肺刺蟎屬物種 (Pneumonyssus spp.)、胸刺蟎屬物種 (Sternostoma spp.) 和瓦蟎屬物種 (Varroa spp.)。

【0401】 軸蟎目 (Actinedida) (前氣門亞目 (Prostigmata)) 和粉蟎目 (Acaridida) (無氣門亞目 (Astigmata))，例如蜂盾蟎屬物種 (Acarapis spp.)、姬螯蟎屬物種 (Cheyletiella spp.)、禽螯蟎屬物種 (Ornithocheyletia spp.)、肉蟎屬物種 (Myobia spp.)、瘡蟎屬物種 (Psorergates spp.)、蠕形蟎屬物種 (Demodex spp.)、恙蟎屬物種 (Trombicula spp.)、犛蟎屬物種 (Listrophorus spp.)、粉蟎屬物種 (Acarus spp.)、食酪蟎屬物種 (Tyrophagus spp.)、嗜木蟎屬物種 (Caloglyphus spp.)、頸下蟎屬物種 (Hypodectes spp.)、翅蟎屬物種 (Pterolichus spp.)、癢蟎屬物種 (Psoroptes spp.)、皮蟎屬物種 (Chorioptes spp.)、耳癢蟎屬物種 (Otodectes

spp.)、疥蟎屬物種 (*Sarcoptes* spp.)、耳蟎屬物種 (*Notoedres* spp.)、烏疥蟎屬物種 (*Knemidocoptes* spp.)、胞蟎屬物種 (*Cytodites* spp.) 以及雞雛蟎屬物種 (*Laminosioptes* spp.)。

【0402】 根據本發明的組成物還適用於保護在如木材、紡織品、塑膠、黏合劑、膠、漆料、紙張和卡片、皮革、地板和建築等情況下的材料免受昆蟲侵染。

【0403】 根據本發明的組成物可以用於例如對抗以下有害生物：甲蟲，如北美家天牛、長毛天牛、傢俱竊蠹、紅毛竊蠹、梳角細脈竊蠹、*Dendrobium pertinex*、松芽枝竊蠹、*Priobium carpini*、褐粉蠹、非洲粉蠹、南方粉蠹、櫟粉蠹、柔毛粉蠹、胸粉蠹、鱗毛粉蠹、材小蠹屬物種、條木小蠹屬物種、咖啡黑長蠹、櫟長蠹、棕異翅長蠹、雙棘長蠹屬物種與竹長蠹；以及還有膜翅類，如藍黑樹蜂、大樹蜂、泰加大樹蜂與 *Urocerus augur*；以及白蟻類，如歐洲木白蟻 (*Kaloterme flavicollis*)、麻頭堆砂白蟻、印巴結構木異白蟻、黃胸散白蟻、桑特散白蟻、歐洲散白蟻、達爾文澳白蟻、內華達古白蟻與家白蟻；以及蛀蟲，如衣魚。

【0404】 根據本發明的化合物可以按未經修飾的形式用作殺有害生物劑，但它們通常以多種方式使用配製佐劑（如載體、溶劑以及表面活性物質）被配製成組成物。該等配製物可以處於不同的實體形式，例如，處於以下形式：撒粉劑、凝膠、可濕性粉劑、水可分散性顆粒劑、水可分散性片劑、發泡顆粒、可乳化的濃縮物、微可乳化濃縮物、水包油乳劑、可流動油、水性分散體、油性分散體、懸乳劑、膠囊懸浮液、可乳化的顆粒劑、可溶性液體、水可溶性濃縮物（以水或水混溶性有機溶劑作為載體）、浸漬的聚合物膜或處於已知的其他形式，例如從 *Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides* [關於殺有害生物劑的FAO和WHO標準的發展和使用的手冊]，聯合國，第1版，二次修訂（2010）中已知的。此類配製物可以直接使用或者可以使用前稀釋再使用。可以用例如水、液體肥料、微量營養素、生物有機體、油或溶劑來進行稀釋。

【0405】 可以藉由例如將活性成分與配製佐劑混合來製備該等配製物以便獲得處於精細分散固體、顆粒、溶液、分散體或乳劑形式的組成物。該等活性成分還可以與其他佐劑（例如精細分散固體、礦物油、植物或動物來源的油、改性的植物或動物來源的油、有機溶劑、水、表面活性物質或其組合）來一起配製。

【0406】 該等活性成分還可以被包含於非常精細的微膠囊中。微膠囊在多孔載體中含有活性成分。這使活性成分能以受控的量值釋放（例如，緩慢釋放）到環境中。微膠囊通常具有從0.1至500微米的直徑。它們包含的活性成分的量按重量計係膠囊重量的約從25%至95%。該等活性成分可以處於整體性的固體的形式、處於固體或液體分散體中的精細顆粒的形式或處於適合溶液的形式。包囊的膜可以包括例如天然的或合成的橡膠、纖維素、苯乙烯/丁二烯共聚物、聚丙烯腈、聚丙烯酸酯、聚酯、聚醯胺、聚脲、聚胺酯或化學改性的聚合物以及澱粉黃原酸酯、或熟悉該項技術者已知的其他聚合物。可替代地，可以形成非常精細的微膠囊，其中活性成分在基礎物質的固體基質中是以精細分散顆粒的形式被包含的，但該等微膠囊本身未經包裹。

【0407】 適合於製備根據本發明的組成物的配製佐劑本身係已知的。作為液體載體可以使用：水、甲苯、二甲苯、石油醚、植物油、丙酮、甲基乙基酮、環己酮、酸酐、乙腈、乙醯苯、乙酸戊酯、2-丁酮、碳酸丁烯酯、氯苯、環己烷、環己醇、乙酸烷基酯、二丙酮醇、1,2-二氯丙烷、二乙醇胺、對-二乙基苯、二甘醇、松脂酸二乙二醇酯、二甘醇丁基醚、二甘醇乙基醚、二甘醇甲醚、*N,N*-二甲基甲醯胺、二甲基亞砷、1,4-二噁吡、二丙二醇、二丙二醇甲基醚、雙丙甘醇二苯甲酸酯、二丙二醇、烷基吡咯啉酮、乙酸乙酯、2-乙基己醇、碳酸乙烯酯、1,1,1-三氯乙烷、2-庚酮、 α -蒎烯、*d*-蒎烯、乳酸乙酯、乙二醇、乙二醇丁基醚、乙二醇甲基醚、 γ -丁內酯、丙三醇、乙酸甘油酯、二乙酸甘油酯、三乙酸甘油酯、十六烷、己二醇、乙酸異戊基酯、乙酸異冰片基(*bornyl*)酯、異辛烷、異佛耳酮、異

丙苯、肉豆蔻酸異丙酯、乳酸、月桂胺、亞異丙基丙酮、甲氧基丙醇、甲基異戊基酮、甲基異丁基酮、月桂酸甲酯、辛酸甲酯、油酸甲酯、二氯甲烷、間二甲苯、正己烷、正辛胺、十八烷酸、辛胺乙酸酯、油酸、油胺、鄰二甲苯、苯酚、聚乙二醇、丙酸、乳酸丙酯、碳酸丙烯酯、丙二醇、丙二醇甲基醚、對-二甲苯、甲苯、磷酸三乙酯、三乙二醇、二甲苯磺酸、石蠟、礦物油、三氯乙烯、全氯乙烯、乙酸乙酯、乙酸戊酯、乙酸丁酯、丙二醇甲基醚、二乙二醇甲基醚、甲醇、乙醇、異丙醇以及更高分子量的醇，例如戊醇、四氫呋喃醇、己醇、辛醇、乙二醇、丙二醇、甘油、*N*-甲基-2-吡咯啉酮等。

【0408】 適合的固體載體係例如滑石、二氧化鈦、葉蠟石黏土、矽石、厄帖浦石黏土、矽藻土、石灰石、碳酸鈣、膨潤土、鈣蒙脫土、棉籽殼、小麥粉、大豆粉、浮石、木粉、經研磨的胡桃殼、木質素和類似的物質。

【0409】 許多表面活性物質可以有利地用在固體和液體配製物兩者中，尤其是在使用前可被載體稀釋的那些配製物中。表面活性物質可以是陰離子的、陽離子的、非離子的或聚合的並且它們可以用作乳化劑、濕潤劑或懸浮劑或用於其他目的。典型的表面活性物質包括例如烷基硫酸酯的鹽，如十二烷基硫酸二乙醇銨；烷基芳基磺酸酯的鹽，如十二烷基苯磺酸鈣；烷基酚/環氧烷加成產物，如乙氧基化壬基苯酚；醇/環氧烷加成產物，如乙氧基化十三烷醇；皂，如硬脂酸鈉；烷基萘磺酸酯的鹽，如二丁基萘磺酸鈉；磺基琥珀酸二烷基酯的鹽，如二(2-乙基己基)磺基琥珀酸鈉；山梨糖醇酯，如山梨糖醇油酸酯；季胺，如氯化十二烷基三甲基銨；脂肪酸的聚乙二醇酯，如聚乙二醇硬脂酸酯；環氧乙烷和環氧丙烷的嵌段共聚物；以及磷酸單烷基酯和二烷基酯的鹽；以及還有其他物質，例如描述於：*McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual* [麥卡琴清潔劑和乳化劑年鑒]，MC出版公司 (MC Publishing Corp.)，裡奇伍德，新澤西州 (Ridgewood New Jersey) (1981)。

【0410】 可以用於殺有害生物配製物的另外的佐劑包括結晶抑制劑、黏度改性劑、懸浮劑、染料、抗氧化劑、發泡劑、光吸收劑、混合助劑、消泡劑、錯合劑、中和或改變pH的物質和緩衝液、腐蝕抑制劑、香料、濕潤劑、吸收增強劑、微量營養素、增塑劑、助滑劑、潤滑劑、分散劑、增稠劑、防凍劑、殺微生物劑、以及液體和固體肥料。

【0411】 根據本發明的組成物可以包括添加劑，該添加劑包括植物或動物來源的油、礦物油、此類油的烷基酯或此類油與油衍生物的混合物。在根據本發明的組成物中的油添加劑的量通常是基於該待施用的混合物的從0.01%到10%。例如，可以在噴霧混合物已經製備之後將該油添加劑以所希望的濃度添加到噴霧罐中。較佳的油添加劑包括礦物油或植物來源的油，例如菜籽油、橄欖油或葵花籽油；乳化的植物油；植物來源的油的烷基酯，例如甲基衍生物；或動物來源的油，如魚油或牛脂。較佳的油添加劑包括C₈-C₂₂脂肪酸的烷基酯，尤其是C₁₂-C₁₈脂肪酸的甲基衍生物，例如月桂酸、棕櫚酸以及油酸的甲基酯（分別為月桂酸甲酯、棕櫚酸甲酯和油酸甲酯）。許多油衍生物獲知於Compendium of Herbicide Adjuvants[除草劑佐劑綱要]，第10版，南伊利諾大學，2010。

【0412】 該等本發明組成物總體上包括按重量計從0.1%至99%，尤其是按重量計從0.1%至95%的本發明的化合物以及按重量計從1%至99.9%的配製佐劑，該配製佐劑較佳的是包括按重量計從0至25%的表面活性物質。而商用產品可以較佳的是被配製為濃縮物，最終使用者將通常使用稀釋配製物。

【0413】 施用比率在寬範圍之內變化並且取決於土壤的性質、施用方法、作物植物、待控制的有害生物、主要氣候條件、以及受施用方法、施用時間以及目標作物支配的其他因素。一般來講，可以將化合物以從1 l/ha至2000 l/ha、尤其是從10 l/ha到1000 l/ha的比率施用。

【0414】 較佳的配製物可以具有以下組成（重量%）：

可乳化的濃縮物：

活性成分： 1%至95%，較佳的是60%至90%

表面活性劑： 1%至30%，較佳的是5%至20%

液體載體： 1%至80%，較佳的是1%至35%

塵劑：

活性成分： 0.1%至10%，較佳的是0.1%至5%

固體載體： 99.9%至90%，較佳的是99.9%至99%

懸浮液濃縮物：

活性成分： 5%至75%，較佳的是10%至50%

水： 94%至24%，較佳的是88%至30%

表面活性劑： 1%至40%，較佳的是2%至30%

可濕性粉劑：

活性成分： 0.5%至90%，較佳的是1%至80%

表面活性劑： 0.5%至20%，較佳的是1%至15%

固體載體： 5%至95%，較佳的是15%至90%

顆粒劑：

活性成分： 0.1%至30%，較佳的是0.1%至15%

固體載體： 99.5%至70%，較佳的是97%至85%

【0415】 以下實例進一步展示了（但不限制）本發明。

可濕性粉劑	a)	b)	c)
活性成分	25%	50%	75%
木質素磺酸鈉	5%	5%	-
月桂基硫酸鈉	3%	-	5%
二異丁基萘磺酸鈉	-	6%	10%
苯酚聚乙二醇醚（7-8 mol的環氧乙烷）	-	2%	-
高度分散的矽酸	5%	10%	10%
高嶺土	62%	27%	-

【0416】 將該組合與該等佐劑充分混合並且將混合物在適當的研磨機中充分研磨，從而獲得了可以用水稀釋而給出所希望的濃度的懸浮液的可濕性粉劑。

乾種子處理用的粉劑	a)	b)	c)
活性成分	25%	50%	75%
輕質礦物油	5%	5%	5%
高度分散的矽酸	5%	5%	-
高嶺土	65%	40%	-
滑石	-		20%

【0417】 將該組合與佐劑充分混合並且將該混合物在適合的研磨機中充分研磨，從而獲得可以直接用於種子處理的粉劑。

可乳化濃縮物	
活性成分	10%
辛基酚聚乙二醇醚（4-5 mol的環氧乙烷）	3%
十二烷基苯磺酸鈣	3%
蓖麻油聚乙二醇醚（35 mol的環氧乙烷）	4%
環己酮	30%
二甲苯混合物	50%

【0418】 在植物保護中可以使用的具有任何所要求的稀釋的乳液可以藉由用水稀釋從這種濃縮物中獲得。

塵粉劑	a)	b)	c)
活性成分	5%	6%	4%
滑石	95%	-	-
高嶺土	-	94%	-
礦物填料	-	-	96%

【0419】 藉由將該組合與載體混合並且將混合物在適當的研磨機中研磨而獲得即用型塵劑。此類粉劑還可以用於種子的乾拌種。

擠出機顆粒	
活性成分	15%
木質素磺酸鈉	2%
羧甲基纖維素	1%
高嶺土	82%

【0420】 將該組合與該等佐劑混合並且研磨，並且將混合物用水濕潤。將混合物擠出並且然後在空氣流中乾燥。

包衣的顆粒	
活性成分	8%
聚乙二醇（分子量200）	3%
高嶺土	89%

【0421】 將這種精細研磨的組合在混合器中均勻地施用於用聚乙二醇濕潤的高嶺土中。以此方式獲得無塵的包衣的顆粒。

懸浮液濃縮物

活性成分	40%
丙二醇	10%
壬基酚聚乙二醇醚（15 mol的環氧乙烷）	6%
木質素磺酸鈉	10%
羧甲基纖維素	1%
矽酮油（處於在水中75%的乳液的形式）	1%
水	32%

【0422】 將精細地研磨的組合與佐劑緊密地混合，得到懸浮液濃縮物，從該懸浮液濃縮物可以藉由用水稀釋獲得任何所希望的稀釋度的懸浮液。使用此類稀釋物，可以藉由噴霧、澆灌或浸漬對活的植物連同植物繁殖材料進行處理並且對其針對微生物侵染進行保護。

種子處理用的可流動性濃縮物

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莫耳EO	2%
1,2-苯并異噻唑啉-3-酮（處於在水中20%的溶液形式）	0.5%
單偶氮-顏料鈣鹽	5%
矽酮油（處於在水中75%的乳液的形式）	0.2%
水	45.3%

【0423】 將精細地研磨的組合與佐劑緊密地混合，得到懸浮液濃縮物，從該懸浮液濃縮物可以藉由用水稀釋獲得任何所希望的稀釋度的懸浮液。使用此

類稀釋物，可以藉由噴霧、澆灌或浸漬對活的植物連同植物繁殖材料進行處理並且對其針對微生物侵染進行保護。

緩釋的膠囊懸浮液

【0424】 將28份的組合與2份的芳香族溶劑以及7份的甲苯二異氰酸酯/聚甲烯 (polymethylene)-聚苯基異氰酸酯-混合物 (8:1) 進行混合。將此混合物在1.2份的聚乙烯醇、0.05份的消泡劑以及51.6份的水的混合物中進行乳化直至達到所希望的粒度。向此乳液中添加在5.3份的水中的2.8份的1,6-己二胺混合物。將混合物攪拌直至聚合反應完成。將獲得的膠囊懸浮液藉由添加0.25份的增稠劑以及3份的分散劑進行穩定。該膠囊懸浮液配製物包含28%的活性成分。介質膠囊的直徑係8-15微米。將所得配製物作為適用於此目的裝置中的水性懸浮液施用到種子上。

【0425】 配製物類型包括乳液濃縮物 (EC)、懸浮液濃縮物 (SC)、懸乳液 (SE)、膠囊懸浮液 (CS)、水可分散性顆粒劑 (WG)、可乳化的顆粒劑 (EG)、油包水型乳液 (EO)、水包油型乳液 (EW)、微乳液 (ME)、油分散體 (OD)、油懸劑 (OF)、油溶性液劑 (OL)、可溶性濃縮物 (SL)、超低容量懸浮液 (SU)、超低容量液劑 (UL)、母藥 (TK)、可分散性濃縮物 (DC)、可濕性粉劑 (WP)、可溶性顆粒劑 (SG) 或與農業上可接受的佐劑組合的任何技術上可行的配製物。

【0426】 製備實例：

「Mp」係指以°C計的熔點。自由基表示甲基。¹H NMR測量值在Bruker 400 MHz光譜儀上記錄，化學位移相對於TMS標準品以ppm給出。光譜在如指定的氘代溶劑中測量。用以下LCMS方法中的任一種來表徵該等化合物。對於每種化合物獲得的特徵性LCMS值係保留時間 (「Rt」，以分鐘記錄) 和測得的分子離子 (M+H)⁺或(M-H)⁻。

LCMS方法：

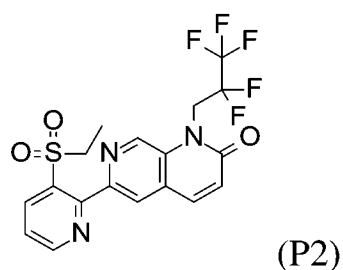
方法1：

【0427】 在來自沃特斯公司 (Waters) 的質譜儀 (SQD單四極質譜儀) 上記錄光譜, 該質譜儀配備有電灑源 (極性: 正離子或負離子, 全掃描, 毛細管: 3.00 kV, 錐範圍: 41 V, 源溫度: 150°C, 去溶劑化溫度: 500°C, 錐氣體流量: 50 L/Hr, 去溶劑化氣體流量: 1000 L/Hr, 質量範圍: 110至800 Da) 以及來自沃特斯的H類UPLC: 二元泵、經加熱管柱室以及二極體陣列檢測器。管柱: Waters UPLC HSS T3 C18, 1.8 μm, 30 x 2.1 mm, 溫度: 40°C, DAD波長範圍 (nm): 210至400, 溶劑梯度: A = 水 + 5% 乙腈 + 0.1% HCOOH, B = 乙腈 + 0.05% HCOOH: 梯度: 0 min 10% B; 0.-0.2 min 10%-50%B; 0.2-0.7 min 50%-100% B; 0.7-1.3 min 100% B; 1.3-1.4 min 100%-10% B; 1.4-1.6 min 10% B; 流量 (mL/min) 0.6。

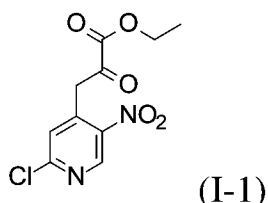
方法2：

【0428】 在來自安捷倫科技公司 (Agilent Technologies) 的質譜儀 (6410 三重四極質譜儀) 上記錄光譜, 該質譜儀配備有電灑源 (極性: 正離子或負離子, MS2掃描, 毛細管: 4.00 kV, 碎裂電壓: 100 V, 去溶劑化溫度: 350°C, 氣體流量: 11 L/min, 霧化器氣體: 45 psi, 質量範圍: 110至1000 Da) 以及來自安捷倫公司的1200系列HPLC: 四元泵、經加熱管柱室以及二極體陣列檢測器。管柱: KINETEX EVO C18, 2.6 μm, 50 x 4.6 mm, 溫度: 40°C, DAD波長範圍 (nm): 210至400, 溶劑梯度: A = 水 + 5% 乙腈 + 0.1% HCOOH, B = 乙腈 + 0.1% HCOOH: 梯度: 0 min 0% B, 100%A; 0.9-1.8 min 100% B; 流量 (mL/min) 1.8。

【0429】 實例H1: 6-(3-乙基磺醯基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-2-酮 (化合物P2) 的製備

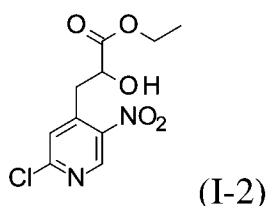


步驟1：3-(2-氯-5-硝基-4-吡啶基)-2-側氧基-丙酸乙酯（中間體I-1）的製備



【0430】 在室溫下在10分鐘的時間段內向在氮氣氛下的2-氯-4-甲基-5-硝基吡啶（CAS 23056-33-9，1.00 g，5.79 mmol）在草酸二乙酯（7.59 mL，54.5 mmol）中的溶液中添加1,8-二氮雜雙環[5.4.0]十一碳-7-烯（1.15 mL，7.53 mmol）。在室溫下攪拌反應混合物過夜。然後將反應混合物倒入冰冷的水（10 mL）中，用2 N鹽酸（3 mL）酸化並攪拌5分鐘。傾析出溶劑，並將所得殘餘物在冰冷的甲醇中攪拌20分鐘。將沈澱物過濾並減壓乾燥以得到所需產物（1.42 g）。LCMS（方法1）：273 (M+H)⁺，Rt 0.99 min。

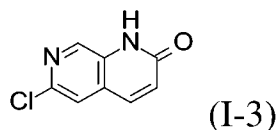
步驟2：3-(2-氯-5-硝基-4-吡啶基)-2-羥基-丙酸乙酯（中間體I-2）的製備



【0431】 在0°C下向3-(2-氯-5-硝基-4-吡啶基)-2-側氧基-丙酸乙酯（如上所述製備的中間體I-1，0.500 g，1.80 mmol）在四氫呋喃（4 mL）和水（1 mL）中的冰冷卻的溶液中分批添加硼氫化鈉（70 mg，1.8 mmol）。將反應混合物在0°C下攪拌15分鐘。將冰冷的水添加到反應混合物中，並在0°C下用飽和氯化銨水溶液將其淬滅。將所得懸浮液用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機層經硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮，以得到所需產物（0.480 g），將其不經進一步純化而使用。

LCMS (方法1): 275 (M+H)⁺, Rt 0.89 min。

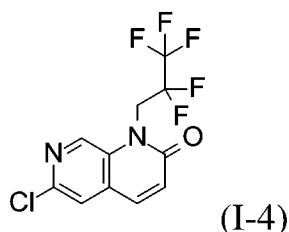
步驟3: 6-氯-1H-1,7-吡啶-2-酮 (中間體I-3) 的製備



【0432】 在室溫下向3-(2-氯-5-硝基-4-吡啶基)-2-羥基-丙酸乙酯 (如上所述製備的中間體I-2, 0.400 g, 0.970 mmol) 在乙酸 (6 mL) 中的溶液中添加鐵 (0.220 g, 3.90 mmol)。將反應混合物加熱至70°C持續30分鐘。然後在70°C下向此反應混合物中添加1,4-二噁唑 (4 mL) 和6 N鹽酸 (3 mL)。將溫度升至90°C並保持攪拌持續4小時。冷卻至室溫後, 將反應混合物經矽藻土過濾, 並用乙酸乙酯洗滌。將濾液減壓濃縮。將獲得的殘餘物用水 (20 mL) 稀釋, 冷卻至0°C, 並用飽和碳酸氫鈉水溶液 (25 mL) 中和。將懸浮液過濾並減壓乾燥。將粗殘餘物溶於乙醇 : 1,2-二氯乙烷 (1 : 1, 20 mL) 中, 並加熱至70°C持續30分鐘。將所得的熱溶液經矽藻土過濾並減壓濃縮以得到呈棕色固體的所需產物 (0.125 g)。

LCMS (方法1): 181 (M+H)⁺, Rt 0.38 min。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 6.82 (d, *J* = 9.54 Hz, 1 H) 7.83 (s, 1 H) 7.92 (d, *J* = 9.54 Hz, 1 H) 8.44 (s, 1 H) 11.99 - 12.23 (m, 1 H)。

步驟4: 6-氯-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮的製備
(中間體I-4)

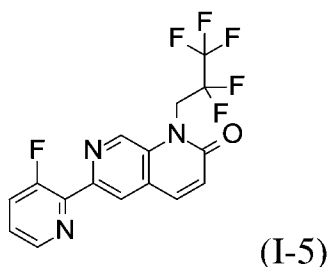


【0433】 在室溫下, 向6-氯-1H-1,7-吡啶-2-酮 (如上所述製備的中間體I-3, 2.50 g, 13.8 mmol) 在四氫呋喃 (50 mL) 中的溶液中添加碳酸鉀 (4.98 g, 36.0 mmol) 和2,2,3,3,3-五氟丙基三氟甲磺酸酯 (3.31 mL, 19.4 mmol)。將反應混合

物在70°C下攪拌9小時，並且然後在50°C下攪拌過夜。冷卻至室溫後，將其倒入水中並用乙酸乙酯萃取。將合併的有機層用鹽水洗滌、經硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的乙酸乙酯）純化得到所需產物（0.900 g）。LCMS（方法1）：313 (M+H)⁺，Rt 1.03 min。

【0434】 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 5.03 (br s, 2 H) 6.97 (d, *J* = 9.66 Hz, 1 H) 7.51 (s, 1 H) 7.67 (d, *J* = 9.66 Hz, 1 H) 8.57 (s, 1 H)。

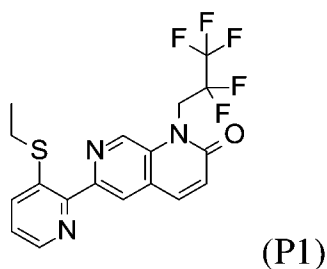
步驟5：6-(3-氟-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-喹啉-2-酮（中間體I-5）的製備



【0435】 向6-氟-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-喹啉-2-酮（如上所述製備的中間體I-4，0.800 g，2.56 mmol）在1,4-二噁咁（15 mL）中的溶液中添加2-二環己基膦基-2',4',6'-三異丙基聯苯（XPhos）（0.30 g，0.61 mmol）。在添加乙酸鈣（II）（59 mg，0.26 mmol）之前，將反應混合物在氮氣氛下脫氣持續15分鐘。在添加三丁基-(3-氟-2-吡啶基)錫烷（1.51 g，3.84 mmol）之前，將反應混合物再次脫氣持續另外15分鐘。然後將其加熱至90°C並且攪拌過夜。冷卻至室溫後，將其倒入水中並用乙酸乙酯萃取。將合併的有機層用鹽水洗滌、經硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的乙酸乙酯）純化得到所需產物（0.210 g）。LCMS（方法1）：374 (M+H)⁺，Rt 0.97 min。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 4.92 - 5.32 (m, 2 H) 6.99 (d, *J* = 9.66 Hz, 1 H) 7.40 - 7.49 (m, 1 H) 7.53 - 7.68 (m, 1 H) 7.77 - 7.88 (d, *J* = 9.66 Hz, 1 H) 8.27 (s, 1 H) 8.60 - 8.68 (m, 1 H) 9.01 (br s, 1 H)。

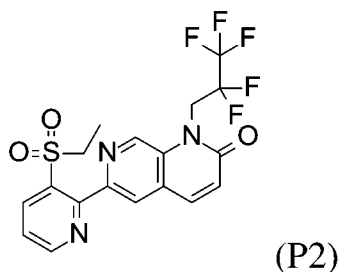
步驟6：6-(3-乙基氫硫基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-喹啉-2-酮（化

合物P1) 的製備



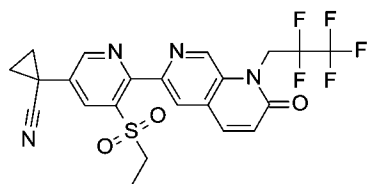
【0436】 在室溫下，在氮氣氛下，向6-(3-氟-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-喹啉-2-酮（如上所述製備的中間體I-5，0.200 g，0.536 mmol）在乾燥的N,N-二甲基甲醯胺（5 mL）中的溶液中添加乙基氫硫基鈉（0.110 g，1.18 mmol）。將反應混合物在室溫下攪拌90分鐘。然後添加水，並將其用乙酸乙酯萃取。將合併的有機層用鹽水洗滌、經硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的梯度乙酸乙酯）純化得到所需產物（55 mg）。LCMS（方法1）：416 (M+H)⁺，Rt 1.07 min。

步驟7：6-(3-乙基磺醯基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-喹啉-2-酮（標題化合物P2）的製備



【0437】 在0°C下，向6-(3-乙基氫硫基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-喹啉-2-酮（如上所述製備的中間體I-6，65 mg，0.16 mmol）在二氯甲烷（5 mL）中的溶液中添加3-氯過苯甲酸（85 mg，0.34 mmol）。將反應混合物在室溫下攪拌2小時。然後將其用飽和碳酸鉀水溶液和水淬滅並用乙酸乙酯萃取。將合併的有機層用鹽水洗滌、經硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的梯度乙酸乙酯）純化得到呈灰白色固體的所需產物（10 mg），mp 217°C-219°C。LCMS（方法1）：448 (M+H)⁺，Rt 0.97 min。

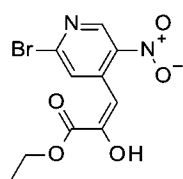
【0438】 實例H2：1-[5-乙基磺醯基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-6-基]-3-吡啶基]環丙烷甲腈（化合物P3）的製備



(P3)

步驟1：(E)-3-(2-溴-5-硝基-4-吡啶基)-2-羥基-丙-2-烯酸乙酯的製備

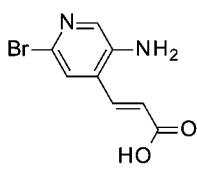
（中間體I-6）



(I-6)

【0439】 在0°C下以三部分向3-(2-溴-5-硝基-4-吡啶基)-2-側氧基-丙酸乙酯（CAS：800401-69-8，200 mg，0.631 mmol）在四氫呋喃（4 ml）中的溶液中添加硼氫化鈉（30 mg，0.757 mmol）。在添加水（5 ml）之前，將混合物在30分鐘內升溫至5°C。用飽和氯化銨水溶液（3 ml）中和反應混合物，並用乙酸乙酯（3 × 20 ml）萃取產物。將合併的有機層經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的梯度乙酸乙酯）純化得到呈黏稠的黃色油狀物的所需產物（110 mg）。LCMS（方法1）：315/317 (M-H)⁻，Rt 0.91 min。

步驟2：(E)-3-(5-胺基-2-溴-4-吡啶基)丙-2-烯酸（中間體I-7）的製備



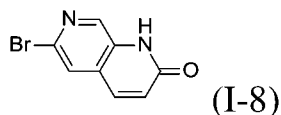
(I-7)

【0440】 在惰性氣氛下將(E)-3-(2-溴-5-硝基-4-吡啶基)-2-羥基-丙-2-烯酸乙酯（如上所述製備的中間體I-6，500 mg，1.57 mmol）溶於乙醇（5 ml）和水（2 ml）中。在室溫下分批添加四羥基二硼（739 mg，7.83 mmol）。

【0441】 將反應混合物在80°C下攪拌2小時。添加冰冷的水（25 ml），並且將產物用乙酸乙酯（3 × 50 ml）萃取。將合併的有機層經無水硫酸鈉乾燥、過

濾並減壓濃縮。將獲得的殘餘物用正戊烷洗滌以產生呈棕色油狀物的標題化合物 (350 mg)。LCMS (方法1): 243/245 (M+H)⁺, Rt 0.20 min。

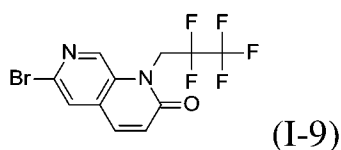
步驟3: 6-溴-1H-1,7-吡啶-2-酮 (中間體I-8) 的製備



【0442】 將(E)-3-(5-氨基-2-溴-4-吡啶基)丙-2-烯酸 (如上所述製備的中間體I-7, 350 mg, 1.44 mmol) 溶於1,4-二噁咁 (3.5 ml) 中。緩慢添加5 N鹽酸水溶液 (3.5 ml, 17.5 mmol), 並將混合物在95°C下攪拌16小時。添加水 (10 ml) 和飽和碳酸氫鈉水溶液 (35 ml), 並且將產物用乙酸乙酯 (4 × 30 ml) 萃取。將合併的有機層經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將殘餘物用正戊烷 (3 × 5 ml) 洗滌, 然後在高真空下乾燥以獲得呈棕色半固體的標題化合物 (130 mg)。LCMS (方法1): 225/227 (M+H)⁺, Rt 0.82 min。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 6.81 (d, *J* = 9.54 Hz, 1 H), 7.90 (d, *J* = 9.54 Hz, 1 H), 7.95 (s, 1 H), 8.41 (s, 1 H), 12.09 (br s, 1 H)。

步驟4: 6-溴-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮的製備

(中間體I-9)

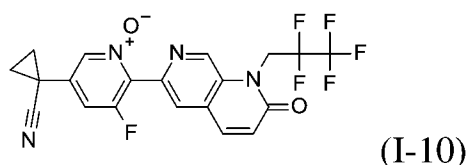


【0443】 在惰性氣氛下, 將6-溴-1H-1,7-吡啶-2-酮 (如上所述製備的中間體I-8, 1.80 g, 8.00 mmol) 溶解在四氫呋喃 (18 ml) 中。添加碳酸鉀 (4.42 g, 32 mmol) 和2,2,3,3,3-五氟丙基三氟甲磺酸酯 (5.47 ml, 9.31 g, 32 mmol), 並將反應在75°C下攪拌4小時。添加更多的碳酸鉀 (4.42 g, 32 mmol) 和2,2,3,3,3-五氟丙基三氟甲磺酸酯 (5.47 ml, 9.31 g, 32 mmol), 並在75°C下繼續攪拌4小時。冷卻至室溫後, 添加水, 並且將產物用乙酸乙酯 (6 × 200 ml) 萃取。將合併的有機層經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法 (在

第 116 頁, 共 197 頁(發明說明書)

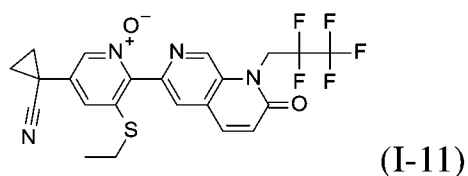
環己烷中的梯度乙酸乙酯)純化得到所需產物(900 mg)。LCMS(方法1): 357/359 (M+H)⁺, Rt 1.00 min。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 5.02 (br s, 2 H) 6.97 (d, 1 H) 7.63 - 7.68 (m, 2 H) 8.56 (s, 1 H)。

步驟5: 1-[5-氟-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啶-6-基]吡啶-1-鎊-3-基]環丙烷甲腈(中間體I-10)的製備



【0444】 將1-(5-氟-1-氧負離子基-吡啶-1-鎊-3-基)環丙烷甲腈(如WO 20/182577中所述製備的, 2.20 g, 12 mmol)在四氫呋喃(22 ml)中的溶液脫氣10分鐘。在0°C下逐滴添加2,2,6,6-四甲基哌啶基氯化鋅氯化鋰錯合物(THF中1.0 mol/L, 19 ml, 19 mmol), 並且在添加後在0°C下繼續攪拌另外15分鐘。在單獨的燒瓶中製備6-溴-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啶-2-酮(如上所述製備的中間體I-9, 4.4 g, 12 mmol)在THF(44 ml)中的溶液, 並將其用氮氣脫氣10分鐘。將此溶液在10°C下添加到第一個溶液中。添加[1,1'-雙(二苯基-膦基)二茂鐵]二氯化鈣(II)(540 mg, 0.74 mmol), 並將反應混合物加熱至60°C持續16小時。添加飽和氯化銨水溶液(70 ml), 並且將產物用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機層用水和鹽水洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法(在環己烷中的梯度乙酸乙酯)純化得到所需產物(3.90 g)。LCMS(方法1): 455 (M+H)⁺, Rt 0.99 min。

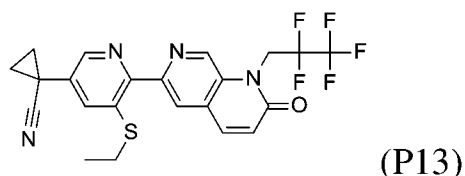
步驟6: 1-[5-乙基氫硫基-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啶-6-基]吡啶-1-鎊-3-基]環丙烷甲腈(中間體I-11)的製備



【0445】 在0°C下, 在氮氣氛下, 向1-[5-氟-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-

(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-6-基]吡啶-1-鎊-3-基]環丙烷甲腈（如上所述製備的中間體I-10，500 mg，1.10 mmol）在*N*-甲基-2-吡咯啉酮（10 ml）中的溶液中添加乙硫醇鈉（174 mg，1.65 mmol）。將混合物在室溫下攪拌2小時。添加冰冷的水（10 ml），並且將產物用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機層用水和鹽水洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的梯度乙酸乙酯）純化得到呈棕色固體的所需產物（320 mg）。LCMS（方法1）：497 (M+H)⁺，Rt 1.01 min。

步驟7：1-[5-乙基氫硫基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-6-基]-3-吡啶基]環丙烷甲腈（化合物P13）的製備

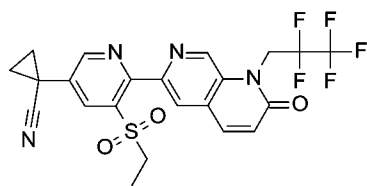


【0446】 將1-[5-乙基氫硫基-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-6-基]吡啶-1-鎊-3-基]環丙烷甲腈（如上所述製備的中間體I-11，600 mg，1.21 mmol）和4,4,5,5-四甲基-2-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜環戊硼烷-2-基)-1,3,2-二氧雜環戊硼烷（307 mg，1.21 mmol）在乙腈（12 ml）中的溶液在70 °C下攪拌12小時。將混合物用水（100 ml）稀釋，並且將產物用乙酸乙酯（3 × 100 ml）萃取。將合併的有機層用鹽水（50 ml）洗滌、經無水硫酸鈉乾燥並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的梯度乙酸乙酯）純化得到呈無色固體的所需產物（430 mg）。

【0447】 LCMS（方法1）：481 (M+H)⁺，Rt 1.12 min。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.38 (t, *J* = 7.3 Hz, 3 H) 1.52 - 1.58 (m, 2 H) 1.85 - 1.90 (m, 2 H) 2.99 (q, *J* = 7.3 Hz, 2 H) 5.10 (br s, 2 H) 6.96 (d, *J* = 9.7 Hz, 1 H) 7.72 (d, *J* = 2.1 Hz, 1 H) 7.82 (d, *J* = 9.5 Hz, 1 H) 8.25 - 8.30 (m, 2 H) 8.91 (s, 1 H)。

步驟8：1-[5-乙基磺基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-6-基]-

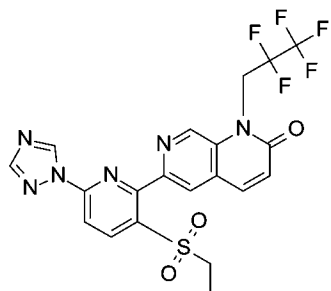
3-吡啶基]環丙烷甲腈（標題化合物P3）的製備



(P3)

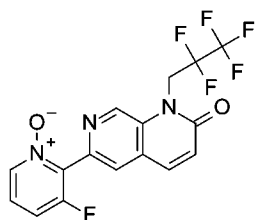
【0448】 在0°C下，向1-[5-乙基氫硫基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-6-基]-3-吡啶基]環丙烷甲腈（如上所述製備的化合物P13，430 mg，0.90 mmol）在乙腈（8.6 ml）中的溶液中添加3-氯過氧苯甲酸（3-chlorobenzenecarboperoxic acid）（486 mg，1.97 mmol）。將反應混合物在室溫下攪拌2小時。然後將其用2 N氫氧化鈉水溶液（20 ml）和水（10 ml）淬滅。將產物用乙酸乙酯（2×20 ml）萃取，將合併的有機層用鹽水（20 ml）洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的梯度乙酸乙酯）純化得到呈無色固體的所需產物（300 mg），mp：224°C-226°C。LCMS（方法1）：513 (M+H)⁺，Rt 1.07 min。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 1.23 - 1.35 (t, 3 H), 1.78 - 1.91 (m, 2 H), 1.94 - 2.01 (m, 2 H) 4.01 (q, 2 H), 5.44 (br t, 2 H), 7.05 (d, 1 H) 8.22 (d, 1 H) 8.24 (s, 1 H) 8.37 (d, 1 H) 8.90 (d, 1 H) 9.11 (s, 1 H)。

【0449】 實例H3：6-[3-乙基磺醯基-6-(1,2,4-三唑-1-基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮（化合物P4）的製備



(P4)

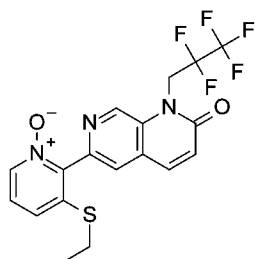
步驟1：6-(3-氟-1-氧負離子基-吡啶-1-鎊-2-基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮（中間體I-12）的製備



(I-12)

【0450】 將3-氟-1-氧負離子基-吡啶-1-鎊 (CAS: 695-37-4, 1.9 g, 17 mmol) 在四氫呋喃 (40 ml) 中的溶液脫氣10分鐘。在0°C下逐滴添加在四氫呋喃中的2,2,6,6-四甲基哌啶基氯化鋅氯化鋰錯合物 (1.0 mol/L, CAS: 1145881-09-9, 17 ml, 17 mmol), 並且在添加後在0°C下繼續攪拌持續另外15分鐘。將6-溴-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮 (如上所述製備的中間體I-9, 4.0 g, 11 mmol) 的溶液溶解在四氫呋喃 (40 ml) 中並脫氣。將此溶液添加到第一個溶液中, 然後添加[1,1'-雙(二苯基膦基)-二茂鐵]二氯化鈣 (II) (490 mg, 0.67 mmol), 並將反應混合物加熱至60°C持續16小時。添加飽和碳酸氫鈉水溶液 (80 ml), 並且將產物用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機層用水和鹽水洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法 (在環己烷中的35%乙酸乙酯) 純化得到所需產物 (4.2 g)。LCMS (方法1): 390 (M+H)⁺, Rt 0.94 min。

步驟2: 6-(3-乙基氫硫基-1-氧負離子基-吡啶-1-鎊-2-基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮 (中間體I-13) 的製備

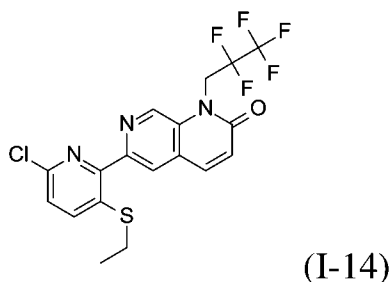


(I-13)

【0451】 在0°C下, 向6-(3-氟-1-氧負離子基-吡啶-1-鎊-2-基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮 (如上所述製備的中間體I-12, 750 mg, 1.93 mmol) 在乾燥的N,N-二甲基甲醯胺 (11.25 ml) 中的溶液中添加乙硫醇鈉 (446 mg, 4.24 mmol)。將混合物在0°C下攪拌15分鐘。添加冰冷的水 (50ml), 並且將產物用乙

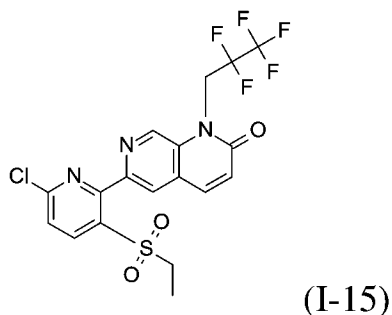
酸乙酯萃取三次。將合併的有機層用水和鹽水洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮以產生標題化合物 (750 mg)。LCMS (方法1): 432 (M+H)⁺, Rt 0.77 min。

步驟3: 6-(6-氯-3-乙基氫硫基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-喹啉-2-酮 (中間體I-14) 的製備



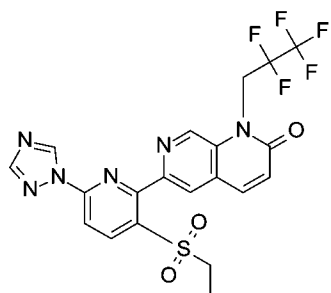
【0452】 將6-(3-乙基氫硫基-1-氧負離子基-吡啶-1-鎗-2-基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-喹啉-2-酮 (如上所述製備的中間體I-13, 3.0 g, 7.0 mmol) 溶解在磷醯氯 (30 ml) 中。將溶液在室溫下攪拌2小時。將反應混合物緩慢倒在冰水上、用飽和碳酸氫鈉水溶液中中和, 並且將產物用乙酸乙酯 (3 × 50 ml) 萃取。將合併的有機層經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法 (在環己烷中的梯度乙酸乙酯) 純化得到所需產物 (1.2g)。LCMS (方法1): 450/452 (M+H)⁺, Rt 1.18 min。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.37 (t, 3 H) 2.96 (q, 2 H) 5.12 (br s, 2 H) 6.98 (d, 1 H) 7.34 (d, 1 H) 7.71 (d, 1 H) 7.86 (d, 1 H) 8.34 (s, 1 H) 8.92 (s, 1 H)。

步驟4: 6-(6-氯-3-乙基磺醯基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-喹啉-2-酮 (中間體I-15) 的製備



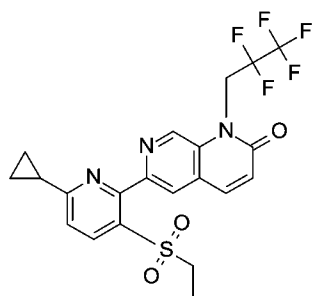
【0453】 向0°C下的6-(6-氯-3-乙基氫硫基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-2-酮(如上所述製備的中間體I-14, 1.2 g, 2.7 mmol)在三氟甲基苯(12 ml)中的溶液中分批添加3-氯過氧苯甲酸(1.4 g, 5.9 mmol)。將混合物在室溫下攪拌1小時,然後傾倒在飽和碳酸氫鈉水溶液上,並將產物用乙酸乙酯(3 × 80 ml)萃取。將合併的有機層經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法(在環己烷中的梯度乙酸乙酯)純化得到呈無色固體的所需產物(1.1 g)。LCMS(方法1): 482/484 (M+H)⁺, Rt 1.10 min。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.43 (t, 3 H) 3.97 (q, 2 H) 5.13 (br s, 2 H) 7.00 (d, 1 H) 7.60 (d, 1 H) 7.83 (d, 1 H) 8.08 - 8.12 (m, 1 H) 8.46 (d, 1 H) 8.78 (s, 1 H)。

步驟5: 6-[3-乙基磺醯基-6-(1,2,4-三唑-1-基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-2-酮(標題化合物P4)的製備



【0454】 向6-(6-氯-3-乙基磺醯基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-2-酮(如上所述製備的中間體I-15, 350 mg, 0.73 mmol)在乙腈(3.5 ml)中的溶液中添加1H-1,2,4-三唑(75.3 mg, 1.09 mmol)和碳酸鉀(151 mg, 1.09 mmol)。將反應混合物在90°C下攪拌4小時、然後用水稀釋。濾出沈澱的產物。將粗材料藉由矽膠快速層析法(在乙酸乙酯中的梯度甲醇)純化得到呈無色固體的所需產物(230 mg), mp: 314°C-316°C。LCMS(方法1): 515 (M+H)⁺, Rt 1.07 min。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 1.30 (t, 3 H) 4.04 (q, 2 H) 5.46 (br s, 2 H) 7.08 (d, 1 H) 8.16 (d, 1 H) 8.20 (br d, 1 H) 8.44 (s, 1 H) 8.50 (s, 1 H) 8.70 (d, 1 H) 9.15 (s, 1 H) 9.65 (s, 1 H)。

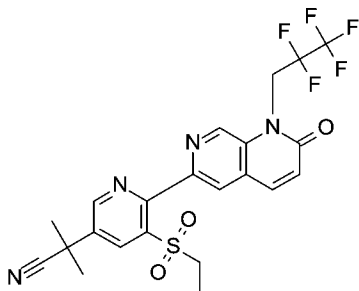
【0455】 實例H4：6-(6-環丙基-3-乙基磺醯基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮（化合物P5）的製備



(P5)

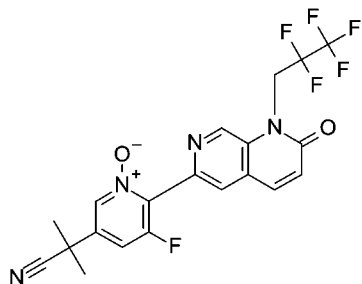
【0456】 向6-(6-氯-3-乙基磺醯基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮（如上所述製備的中間體I-15，400 mg，0.81 mmol）在甲苯（8 ml）和水（1.2 ml）中的溶液中添加碳酸鉀（344 mg，2.49 mmol）和環丙基硼酸（188 mg，2.08 mmol）。將混合物用氮氣脫氣10分鐘，然後添加[1,1'-雙(二苯基-膦基)二茂鐵]二氧化鈣 (II)（35 mg，0.042 mmol）。將反應混合物在微波中在110°C下加熱1.5小時、用水稀釋並將產物用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機層用水和鹽水洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的梯度乙酸乙酯）純化得到呈固體的所需產物（210 mg），mp：212°C-214°C。LCMS（方法1）：488 (M+H)⁺，Rt 1.16 min。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 1.11 - 1.15 (m, 4 H) 1.25 (t, 3 H) 2.28 - 2.38 (m, 1 H) 3.89 (q, 2 H) 5.44 (br t, 2 H) 7.03 (d, 1 H) 7.66 (d, 1 H) 8.16 (s, 1 H) 8.21 (d, 1 H) 8.27 (d, 1 H) 9.07 (s, 1 H)。

【0457】 實例H5：2-[5-乙基磺醯基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-6-基]-3-吡啶基]-2-甲基-丙腈（化合物P6）的製備



(P6)

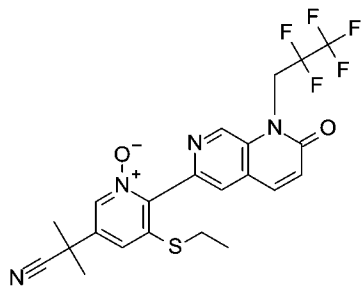
步驟1：2-[5-氟-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啉-6-基]吡啶-1-鎊-3-基]-2-甲基-丙腈（中間體I-16）的製備



(I-16)

【0458】 將2-(5-氟-1-氧負離子基-吡啶-1-鎊-3-基)-2-甲基-丙腈（如WO 20/182577中所述製備的，1.5 g，8.4 mmol）在四氫呋喃（20 ml）中的溶液脫氣10分鐘。在0°C下在15分鐘內向其中滴加在四氫呋喃中的2,2,6,6-四甲基哌啶基氯化鋅氯化鋰錯合物（1 mmol/ml，CAS：1145881-09-9，8.4 ml，8.4 mmol）。在單獨的燒瓶中，將6-溴-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啉-2-酮（如上所述製備的中間體I-9，2.0 g，5.6 mmol）在四氫呋喃（20 ml）中的溶液用氮氣脫氣10分鐘。將此溶液在10°C下添加到第一個溶液中，然後添加[1,1'-雙(二苯基膦基)-二茂鐵]二氯化鈣 (II)（250 mg，0.34 mmol），並將混合物加熱至60°C持續16小時。添加飽和碳酸氫鈉水溶液（30 ml），並且將產物用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機層用水和鹽水洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的35%乙酸乙酯）純化得到呈固體的所需產物（2.2 g）。LCMS（方法1）：457 (M+H)⁺，Rt 0.90 min。

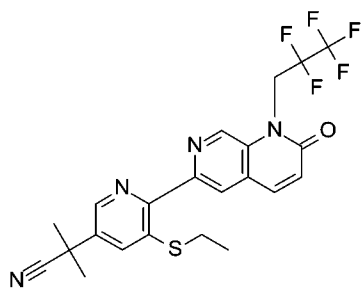
步驟2：2-[5-乙基氫硫基-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啉-6-基]吡啶-1-鎊-3-基]-2-甲基-丙腈（中間體I-17）的製備



(I-17)

【0459】 向在0°C下的2-[5-氟-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-6-基]吡啶-1-鎊-3-基]-2-甲基-丙腈（如上所述製備的中間體I-16，1.20 g，2.63 mmol）在乾燥N,N-二甲基甲醯胺（18 ml）中的溶液中添加乙硫醇鈉（608 mg，5.79 mmol）。將混合物在0°C下攪拌15分鐘，然後添加冰冷的水（50 ml），並且將產物用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機層用水和鹽水洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮以產生標題化合物（1.1 g）。LCMS（方法1）：499 (M+H)⁺，Rt 0.93 min。

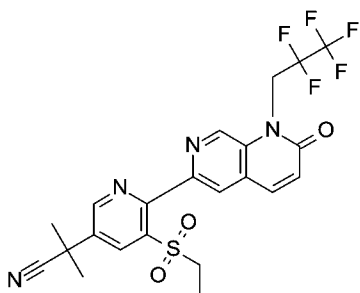
步驟3：2-[5-乙基氫硫基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-6-基]-3-吡啶基]-2-甲基-丙腈（化合物P17）的製備



(P17)

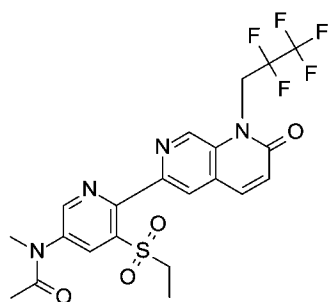
【0460】 將2-[5-乙基氫硫基-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-6-基]吡啶-1-鎊-3-基]-2-甲基-丙腈（如上所述製備的中間體I-17，1.1 g，2.2 mmol）溶解在四氫呋喃（22 ml）中。在0°C下添加飽和氯化銨水溶液（11 ml），然後添加金屬鋅（290 mg，4.4 mmol）。將反應混合物在室溫下攪拌16小時，然後添加水（40 ml），並且將產物用乙酸乙酯（3 × 50 ml）萃取。將合併的有機層經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的乙酸乙酯）純化得到呈淡黃色固體的所需產物（230 mg）。LCMS（方法1）：484 (M+H)⁺，Rt 1.11 min。

步驟4：2-[5-乙基磺基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-6-基]-3-吡啶基]-2-甲基-丙腈（化合物P6）的製備



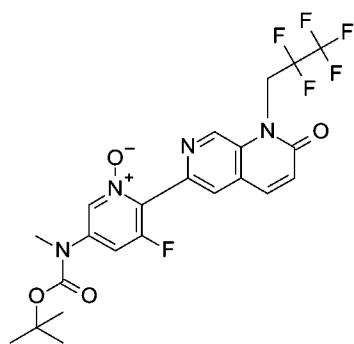
【0461】 向在0°C下的2-[5-乙基氫硫基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啶-6-基]-3-吡啶基]-2-甲基-丙腈（如上所述製備的化合物P17，60 mg，0.124 mmol）在乙腈（8 ml）中的溶液中添加3-氯過氧苯甲酸（70%，67 mg，0.274 mmol）。將混合物在室溫下攪拌2小時。添加2 N氫氧化鈉水溶液（10 ml）和水（10 ml），並且將產物用乙酸乙酯（2×10 ml）萃取。將有機層用鹽水洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的30%乙酸乙酯）純化得到呈無色固體的所需產物（45 mg），mp：245°C-247°C。LCMS（方法1）：515 (M+H)⁺，Rt 1.02 min。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.44 (t, 3 H) 1.89 (s, 6 H) 3.99 (q, 2 H) 5.13 (br s, 2 H) 6.99 (d, 1 H) 7.83 (d, 1 H) 8.09 (s, 1 H) 8.53 (d, 1 H) 8.78 (s, 1 H) 9.09 (d, 1 H)。

【0462】 實例H6：N-[5-乙基磺醯基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啶-6-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙醯胺（化合物P7）的製備



(P7)

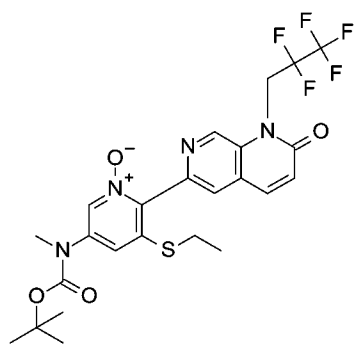
步驟1：N-[5-氟-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啶-6-基]吡啶-1-鎊-3-基]-N-甲基-胺基甲酸三級丁基酯（中間體I-18）的製備



(I-18)

【0463】 將N-(5-氟-1-氧負離子基-吡啶-1-鎊-3-基)-N-甲基-胺基甲酸三級丁基酯（如WO 20/182577中所述製備的，3.0 g，12 mmol）在四氫呋喃（30 ml）中的溶液用氮氣脫氣10分鐘並冷卻至0°C。逐滴添加在四氫呋喃中的2,2,6,6-四甲基哌啶基氯化鋅氯化鋰錯合物（1 mmol/ml，CAS：1145881-09-9，19 ml，19 mmol）。在另一個燒瓶中，將6-溴-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啶-2-酮（如上所述製備的中間體I-9，3.1 g，8.7 mmol）在四氫呋喃（30 ml）中的溶液用氮氣脫氣，然後將兩種溶液混合，並且添加[1,1'-雙(二苯基膦基)-二茂鐵]二氧化鈣 (II)（540 mg，0.74 mmol），並將混合物加熱至60°C持續16小時。添加飽和氯化銨水溶液（70 ml），並且將產物用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機層用水和鹽水洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的65%乙酸乙酯）純化得到呈固體的所需產物（4.3 g）。LCMS（方法1）：519 (M+H)⁺，Rt 1.04 min。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.55 (s, 9 H) 3.34 (s, 3 H) 4.85 - 5.33 (m, 2 H) 6.98 (d, 1 H) 7.38 - 7.55 (m, 1 H) 7.80 (d, 1 H) 8.11 - 8.17 (m, 1 H) 8.36 (s, 1 H) 8.96 (s, 1 H)。

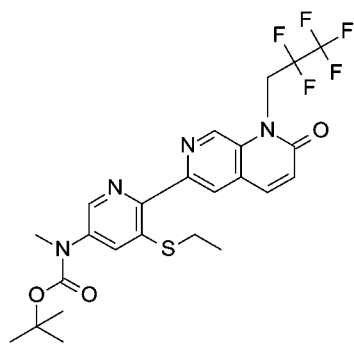
步驟2：N-[5-乙基氫硫基-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啶-6-基]吡啶-1-鎊-3-基]-N-甲基-胺基甲酸三級丁基酯（中間體I-19）的製備



(I-19)

【0464】 向在0°C下的N-[5-氟-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-6-基]吡啶-1-鎗-3-基]-N-甲基-胺基甲酸三級丁基酯（如上所述製備的中間體I-18，4.30 g，8.30 mmol）在乾燥的N-甲基吡咯啶酮（21.5 ml）中的溶液中添加乙硫醇鈉（1.05 g，12.44 mmol）。將混合物在室溫下攪拌2小時，添加冰冷的水（10 ml），並且將產物用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機層用水和鹽水洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在乙酸乙酯中的5%甲醇）純化得到呈半固體的所需產物（3.0 g）。LCMS（方法1）：561 (M+H)⁺，Rt 1.10 min。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.30 (t, 3 H) 1.53 (s, 9 H) 2.88 (q, 2 H) 3.31 (s, 3 H) 4.82 - 5.32 (m, 2 H) 6.95 (d, 1H) 7.29 - 7.43 (m, 1 H) 7.77 (d, 1 H) 7.95 (s, 1 H) 8.17 (d, 1 H) 8.93 (s, 1 H)。

步驟3：N-[5-乙基氫硫基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-6-基]-3-吡啶基]-N-甲基-胺基甲酸三級丁基酯（中間體I-20）的製備

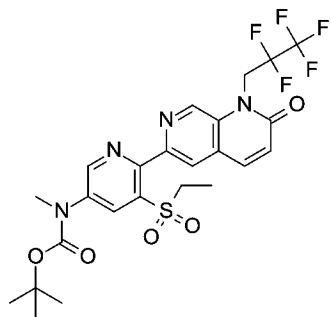


(I-20)

【0465】 向N-[5-乙基氫硫基-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-6-基]吡啶-1-鎗-3-基]-N-甲基-胺基甲酸三級丁基酯（如上所述製備的中間體I-19，2.90 g，5.17 mmol）在乙腈（29 ml）中的溶液中添加4,4,5,5-四

甲基-2-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜環戊硼烷-2-基)-1,3,2-二氧雜環戊硼烷 (1.58 g, 6.21 mmol)。將混合物在60°C下攪拌16小時、用水(100 ml)稀釋，並且將產物用乙酸乙酯(3 × 100 ml)萃取。將合併的有機層用鹽水(50 ml)洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法(在環己烷中的25%乙酸乙酯)純化得到呈無色固體的所需產物(2.2 g)，mp: 172°C-174°C。LCMS(方法1): 545 (M+H)⁺, Rt 1.24 min。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.38 (t, 3 H) 1.52 (s, 9 H) 2.95 (q, 2 H) 3.37 (s, 3H) 5.12 (br s, 2 H) 6.96 (d, 1 H) 7.67 (s, 1 H) 7.83 (d, 1 H) 8.25 (s, 1 H) 8.39 (d, 1 H) 8.92 (s, 1 H)。

步驟4: N-[5-乙基磺醯基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-6-基]-3-吡啶基]-N-甲基-胺基甲酸三級丁基酯(中間體I-21)的製備

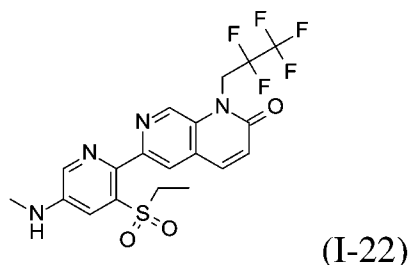


(I-21)

【0466】 向在0°C下的N-[5-乙基磺基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-6-基]-3-吡啶基]-N-甲基-胺基甲酸三級丁基酯(如上所述製備的中間體I-20, 1.10 g, 2.02 mmol)在乙腈(22 ml)中的溶液中添加3-氯過氧苯甲酸(70%, 1.10 g, 4.44 mmol)。將混合物在室溫下攪拌2小時，然後添加2 N氫氧化鈉水溶液(20 ml)和水(20 ml)。將產物用乙酸乙酯(2 × 50ml)萃取，將合併的有機層用鹽水(50ml)洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法(在環己烷中的30%乙酸乙酯)純化得到呈無色固體的所需產物(870mg)，mp: 196°C-198°C。LCMS(方法1): 577 (M+H)⁺, Rt 1.13 min。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.45 (t, 3 H) 1.54 (m, 9 H) 3.42 (s, 3 H) 3.98 (q, 2 H) 5.11 (br s, 2 H) 6.97 (d, 1 H) 7.81 (d, 1 H) 8.06 (s, 1 H) 8.42 (d, 1 H) 8.77 (s, 1 H)

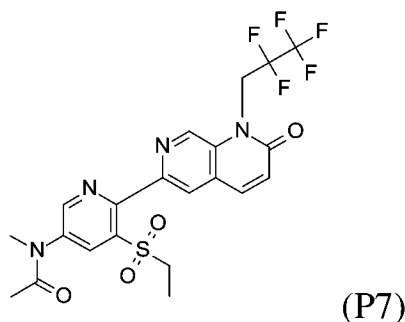
8.88 (d, 1 H)。

步驟5：6-[3-乙基磺醯基-5-(甲基胺基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-
 啉啶-2-酮（中間體I-22）的製備



【0467】 向在0°C下的N-[5-乙基磺醯基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啶-6-基]-3-吡啶基]-N-甲基-胺基甲酸三級丁基酯（如上所述製備的中間體I-21，610 mg，1.06 mmol）在三氟甲苯（12.2 ml）中的溶液中添加三氟乙酸（2.54 g，1.70 ml，21.16 mmol）。將混合物在室溫下攪拌16小時，然後添加飽和碳酸氫鈉水溶液，並且將產物用乙酸乙酯（3 × 50 ml）萃取。將合併的有機層用鹽水洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的乙酸乙酯）純化得到呈淺黃色固體的所需產物（470 mg），mp：224°C-226°C。LCMS（方法1）：477 (M+H)⁺，Rt 1.04 min。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 1.26 (t, 3 H) 2.84 (d, 3 H) 3.96 (q, 2 H) 5.42 (br t, 2 H) 6.74 - 6.83 (m, 1 H) 7.00 (d, 1 H) 7.49 (d, 1 H) 8.09 (s, 1 H) 8.18 (d, 1 H) 8.24 (d, 1 H) 9.00 (s, 1 H)。

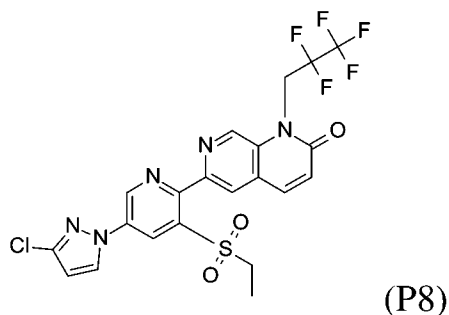
步驟6：N-[5-乙基磺醯基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啶-6-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙醯胺（化合物P7）的製備



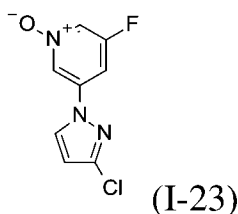
【0468】 向6-[3-乙基磺醯基-5-(甲基胺基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-
 第 130 頁，共 197 頁(發明說明書)

基)-1,7-噻啉-2-酮 (如上所述製備的中間體I-22, 300 mg, 0.63 mmol) 在吡啶 (6 ml) 中的溶液中添加N,N-二甲基吡啶-4-胺 (15.5 mg, 0.126 mmol), 然後添加乙醯氯 (99 mg, 90 μ l, 0.099 mmol)。將混合物在室溫下攪拌4小時, 然後添加水, 並且將產物用乙酸乙酯 (2 \times 50 ml) 萃取。將合併的有機層經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法 (在環己烷中的80%乙酸乙酯) 純化得到呈無色固體的所需產物 (250mg), mp: 280°C-282°C。LCMS (方法1): 519 (M+H)⁺, Rt 0.99 min。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.46 (t, 3 H) 2.09 (br s, 3 H) 3.47 (br s, 3 H) 4.03 (q, 2 H) 4.90 - 5.32 (m, 2 H) 7.01 (d, 1 H) 7.84 (d, 1 H) 8.12 (s, 1 H) 8.41 (d, 1 H) 8.80 (s, 1 H) 8.85 (br s, 1 H)。

【0469】 實例H7: 6-[5-(3-氯吡啶-1-基)-3-乙基磺醯基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-2-酮 (化合物P8) 的製備



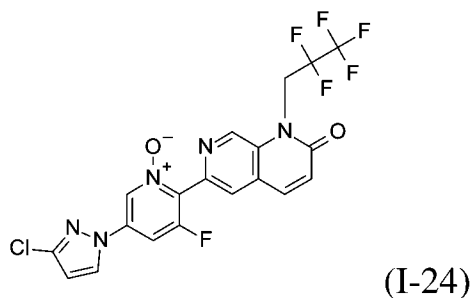
步驟1: (3-氯吡啶-1-基)-5-氟-1-氧負離子基-吡啶-1-鎊 (中間體I-23) 的製備



【0470】 向在0°C下的3-(3-氯吡啶-1-基)-5-氟-吡啶 (CAS: 1374320-30-5, 1.4 g, 7.1 mmol) 在二氯甲烷 (40 ml) 中的溶液中分批添加3-氯過氧苯甲酸 (70%, 3.8 g, 16 mmol)。將混合物升溫至室溫並攪拌16小時。添加飽和碳酸氫鈉水溶液, 並且將產物用乙酸乙酯 (2 \times 100 ml) 萃取。將合併的有機層用鹽水 (70 ml) 洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法 (在

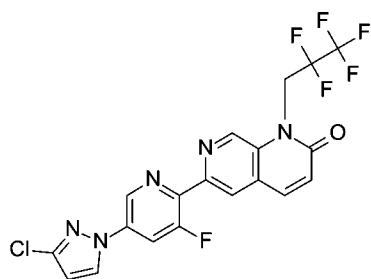
環己烷中的80%乙酸乙酯) 純化得到呈灰白色固體的所需產物 (1.2 g)。LCMS (方法1): 214/216 (M+H)⁺, Rt 0.58 min。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 6.53 (d, 1 H) 7.60 (br d, 1 H) 7.86 - 7.95 (m, 1 H) 8.17 (br s, 1 H) 8.65 (s, 1 H)。

步驟2: 6-[5-(3-氯吡啶-1-基)-3-氟-1-氧負離子基-吡啶-1-鎊-2-基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啶-2-酮 (中間體I-24) 的製備



【0471】 將(3-氯吡啶-1-基)-5-氟-1-氧負離子基-吡啶-1-鎊 (如上所述製備的中間體I-23, 1.5 g, 7.0 mmol) 在四氫呋喃 (18 ml) 中的溶液用氮氣脫氣10分鐘, 並冷卻至10°C。逐滴添加在四氫呋喃中的2,2,6,6-四甲基哌啶基氯化鋅氯化鋰錯合物 (1 mmol/ml, CAS: 1145881-09-9, 7 ml, 7 mmol)。在另一個燒瓶中, 將6-溴-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啶-2-酮 (如上所述製備的中間體I-9, 1.8 g, 4.6 mmol) 在四氫呋喃 (18 ml) 中的溶液用氮氣脫氣, 然後將兩種溶液混合, 並且添加[1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵]二氯化鈣 (II) (230 mg, 0.30 mmol)。將反應混合物加熱至60°C持續15小時。添加飽和碳酸氫鈉水溶液 (60 ml), 並且將產物用乙酸乙酯 (3×60 ml) 萃取三次。將合併的有機層經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法 (在乙酸乙酯中的10%甲醇) 純化得到呈固體的所需產物 (2.0 g)。LCMS (方法1): 490/492 (M+H)⁺, Rt 1.07 min。

步驟3: 6-[5-(3-氯吡啶-1-基)-3-氟-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啶-2-酮 (中間體I-25) 的製備

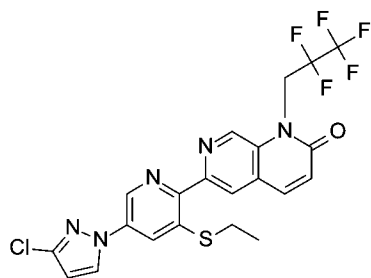


(I-25)

【0472】 向6-[5-(3-氯吡唑-1-基)-3-氟-1-氧負離子基-吡啶-1-鎊-2-基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啶-2-酮（如上所述製備的中間體I-24，1.56 g，3.18 mmol）在乾燥的乙腈（15.6 ml）中的溶液中添加4,4,5,5-四甲基-2-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜環戊硼烷-2-基)-1,3,2-二氧雜環戊硼烷（809 mg，3.18 mmol）。將反應混合物在70°C下攪拌10小時。添加另一批次的4,4,5,5-四甲基-2-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜環戊硼烷-2-基)-1,3,2-二氧雜環戊硼烷（404 mg，1.59 mmol）並且在70°C下繼續攪拌持續9小時。將混合物用水（100 ml）稀釋，並且將產物用乙酸乙酯（3 × 100 ml）萃取。將合併的有機層用鹽水（50 ml）洗滌、經無水硫酸鈉乾燥並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的0至40%乙酸乙酯）純化得到呈粉紅色固體的所需產物（967 mg）。

【0473】 LCMS(方法1): 474/476 (M+H)⁺, Rt 1.11 min. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 5.12 (br s, 2 H) 6.53 (d, 1 H) 7.00 (d, 1 H) 7.85 (d, 1 H) 8.01 (m, 2 H) 8.28 (s, 1 H) 8.91 (d, 1 H) 9.00 (s, 1 H)。

步驟4: 6-[5-(3-氯吡唑-1-基)-3-乙基氫硫基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啶-2-酮（化合物P14）的製備

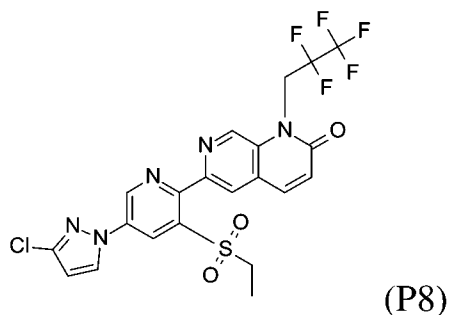


(P14)

【0474】 向6-[5-(3-氯吡唑-1-基)-3-氟-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-

1,7-噻啉-2-酮（如上所述製備的中間體I-25，950 mg，2.0 mmol）在N,N-二甲基甲醯胺（10 ml）中的溶液中添加乙硫醇鈉（250 mg，3.0 mmol）。將混合物在室溫下攪拌7小時，然後添加冰冷的水（50 ml），並且將產物用乙酸乙酯（3 × 100 ml）萃取三次。將合併的有機層用鹽水（50 ml）洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的40%乙酸乙酯）純化得到呈無色固體的所需產物（700mg），mp：231°C-232°C。LCMS（方法1）：516/518 (M+H)⁺，Rt 1.20 min。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.41 (t, 3 H) 3.05 (q, 2 H) 5.11 (br s, 2 H) 6.50 (d, 1 H) 6.97 (d, 1 H) 7.84 (d, 1 H) 7.98 (d, 1 H) 8.09 (d, 1 H) 8.31 (s, 1 H) 8.67 (d, 1 H) 8.93 (s, 1 H)。

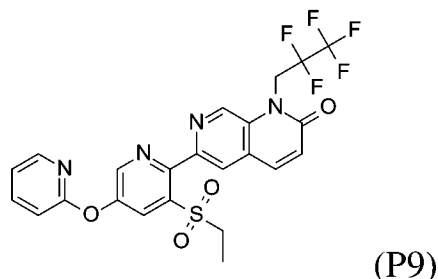
步驟5：6-[5-(3-氯吡啶-1-基)-3-乙基磺醯基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-2-酮（化合物P8）的製備



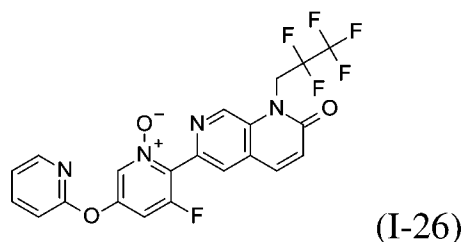
【0475】 向在0°C下的6-[5-(3-氯吡啶-1-基)-3-乙基磺基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-2-酮（如上所述製備的化合物P14，672 mg，1.303 mmol）在三氟甲苯（20 ml）中的溶液中添加3-氯過氧苯甲酸（70%，707 mg，2.87 mmol）。將混合物在室溫下攪拌5小時，然後添加冰冷的水（50 ml），並用2 N氫氧化鈉水溶液鹼化溶液。用乙酸乙酯（3 × 60 ml）萃取產物，將合併的有機層用水（100 ml）和鹽水（50 ml）洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的0至100%乙酸乙酯）純化得到呈無色固體的所需產物（504 mg）。LCMS（方法1）：548/550 (M+H)⁺，Rt 1.13 min。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.47 (t, 3 H) 4.05 (q, 2 H) 5.13 (br s, 2 H) 6.56 (d,

1H) 6.99 (d, 1 H) 7.84 (d, 1 H) 8.03 - 8.09 (m, 1 H) 8.12 (s, 1 H) 8.72 (d, 1 H) 8.79 (s, 1 H) 9.30 (d, 1 H)。

【0476】 實例H8.6-[3-乙基磺醯基-5-(2-吡啶基氧基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮 (化合物P9) 的製備



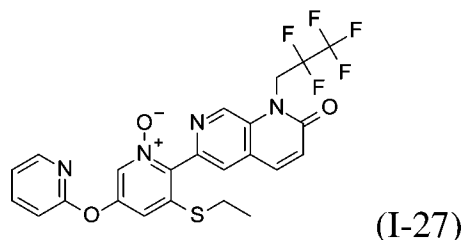
步驟1：6-[3-氟-1-氧負離子基-5-(2-吡啶基氧基)吡啶-1-鎊-2-基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮 (中間體I-26) 的製備



【0477】 將3-氟-1-氧負離子基-5-(2-吡啶基氧基)吡啶-1-鎊 (如WO 20/182577中所述製備的，3.0 g，15.0 mmol) 在四氫呋喃 (30 ml) 中的溶液用氮氣脫氣持續10分鐘並冷卻至0°C。逐滴添加在四氫呋喃中的2,2,6,6-四甲基哌啶基氯化鋅氯化鋰錯合物 (1 mmol/ml，CAS：1145881-09-9，22 ml，22 mmol)，並將混合物在0°C下攪拌15分鐘。在另一個燒瓶中，製備6-溴-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮 (如上所述製備的中間體I-9，4.2 g，12 mmol) 在四氫呋喃 (30 ml) 中的溶液並且將其用氮氣脫氣，然後將兩種溶液混合，並且添加[1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵]二氯化鈣 (II) (640 mg，0.87 mmol)。將反應混合物加熱至60°C持續16小時，然後添加飽和碳酸氫鈉水溶液 (30 ml)，並且將產物用乙酸乙酯萃取三次。將有機層用水和鹽水洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法 (在環己烷中的35%乙酸乙酯) 純化得到呈固體的所需產

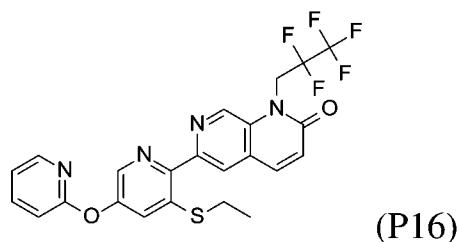
物 (4.0 g)。LCMS (方法1): 483 (M+H)⁺, Rt 1.00 min。

步驟2: 6-[3-乙基氫硫基-1-氧負離子基-5-(2-吡啶基氧基)吡啶-1-鎊-2-基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-2-酮 (中間體I-27) 的製備



【0478】 向在0°C下的6-[3-氟-1-氧負離子基-5-(2-吡啶基氧基)吡啶-1-鎊-2-基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-2-酮(如上所述製備的中間體I-26, 500 mg, 1.04 mmol) 在乾燥的N-甲基吡咯啉酮 (10 ml) 中的溶液中添加乙硫醇鈉 (164 mg, 1.55 mmol)。將混合物在室溫下攪拌5小時。添加更多的乙硫醇鈉 (164 mg, 1.55 mmol), 並在室溫下繼續攪拌16小時。添加冰冷的水 (10 ml), 並且將產物用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機層用水和鹽水洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法 (在乙酸乙酯中的4%甲醇) 純化得到呈棕色黏稠的油狀物的所需產物 (300 mg)。LCMS (方法1): 525 (M+H)⁺, Rt 1.03 min。

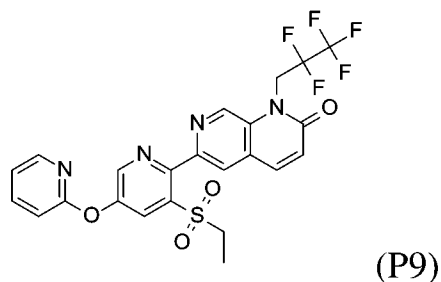
步驟3: 6-[3-乙基氫硫基-5-(2-吡啶基氧基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-2-酮 (化合物P16) 的製備



【0479】 向6-[3-乙基氫硫基-1-氧負離子基-5-(2-吡啶基氧基)吡啶-1-鎊-2-基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-2-酮(如上所述製備的中間體I-27, 5.2 g, 9.91 mmol) 在乾燥的乙腈 (104 ml) 中的溶液中添加4,4,5,5-四甲基-2-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜環戊硼烷-2-基)-1,3,2-二氧雜環戊硼烷 (2.52 g, 9.91 mmol)。將反

應混合物在60°C下攪拌16小時、用水(100 ml)稀釋，並且將產物用乙酸乙酯(3 × 100 ml)萃取。將合併的有機層用鹽水(50 ml)洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法(在環己烷中的65%乙酸乙酯)純化得到呈無色固體的所需產物(1.8 g)。LCMS(方法1): 509 (M+H)⁺, Rt 1.17 min。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.37 (t, 3 H) 2.92 (q, 2 H) 5.13 (br s, 2 H) 6.96 (d, 1 H) 7.07 (d, 1 H) 7.11 (ddd, 1 H) 7.58 (d, 1 H) 7.80 (ddd, 1 H) 7.84 (d, 1 H) 8.22 (d, 1 H) 8.28 (s, 1 H) 8.36 (d, 1 H) 8.93 (s, 1 H)。

步驟4: 6-[3-乙基磺醯基-5-(2-吡啶基氧基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮(化合物P9)的製備

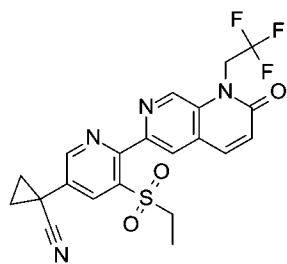


【0480】 向在0°C下的6-[3-乙基氫硫基-5-(2-吡啶基氧基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮(如上所述製備的化合物P16, 350 mg, 0.688 mmol)在乙腈(7 ml)中的溶液中添加3-氯過氧苯甲酸(70%, 373 mg, 1.51 mmol)。將混合物在室溫下攪拌2小時。添加冰冷的水(10 ml)，並且將溶液用2 N氫氧化鈉水溶液(10 ml)鹼化。將產物用乙酸乙酯(2 × 50 ml)萃取，將合併的有機層用鹽水(20 ml)洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法(在環己烷中的30%乙酸乙酯)純化得到呈無色固體的所需產物(195 mg)，mp: 216°C-218°C。LCMS(方法1): 541 (M+H)⁺, Rt 1.11 min。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.46 (t, 3 H) 4.00 (q, 2 H) 5.14 (br s, 2 H) 6.99 (d, 1 H) 7.12 - 7.18 (m, 2 H) 7.81 - 7.87 (m, 2 H) 8.09 (s, 1 H) 8.20 (dd, 1 H) 8.37 (d, 1 H) 8.80 (s, 1 H) 8.83 (d, 1 H)。

【0481】 實例H9: 1-[5-乙基磺醯基-6-[2-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-吡啶-2-酮]-2-吡啶基]-1,7-吡啶-2-酮

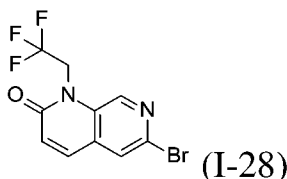
第 137 頁，共 197 頁(發明說明書)

啉啉-6-基]-3-吡啶基]環丙烷甲腈（化合物P10）的製備



(P10)

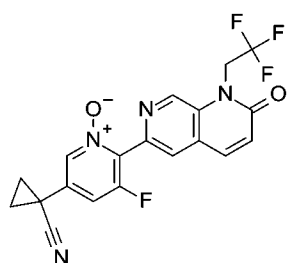
步驟1：6-溴-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-啉啉-2-酮（中間體I-28）的製備



(I-28)

【0482】 向6-溴-1H-1,7-啉啉-2-酮(如上所述製備的中間體I-8, 6.00 g, 25.1 mmol) 在四氫呋喃 (18 ml) 中的溶液中添加碳酸鉀 (12.12 g, 87.7 mmol), 然後添加2,2,2-三氟乙基三氟甲磺酸酯 (18.0 g, 75.19 mmol)。將反應混合物加熱至75°C 持續5小時, 然後減壓除去溶劑。將冰冷的水添加到殘餘物中, 並將產物用乙酸乙酯 (2 × 150 ml) 萃取。將合併的有機層經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法 (在環己烷中的梯度乙酸乙酯) 純化得到呈無色固體的所需產物 (5.0 g)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 5.00 (br d, 2 H) 6.95 (d, 1 H) 7.62 - 7.68 (m, 2 H) 8.58 (s, 1 H)。

步驟2：1-[5-氟-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-啉啉-6-基]吡啶-1-鎊-3-基]環丙烷甲腈（中間體I-29）的製備

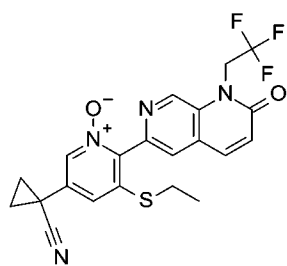


(I-29)

【0483】 將1-(5-氟-1-氧負離子基-吡啶-1-鎊-3-基)環丙烷甲腈（如WO 20/182577中所述製備的, 2.61 g, 14.66 mmol) 在四氫呋喃 (30 ml) 中的溶液脫

氣10分鐘並且冷卻至10°C。在10°C下逐滴添加2,2,6,6-四甲基哌啶基氯化鋅氯化鋰錯合物（THF中1.0 mol/L，14.66 ml，14.66 mmol），並且在10°C下繼續攪拌另外15分鐘。在單獨的燒瓶中製備6-溴-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮（如上所述製備的中間體I-28，3.0 g，9.77 mmol）在四氫呋喃（30 ml）中的溶液，並將其用氫氣脫氣10分鐘。將兩種溶液在10°C下混合，然後添加[1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵]二氯化鈣(II)（474 mg，0.64 mmol），並將反應混合物加熱至60°C持續15小時。添加飽和碳酸氫鈉水溶液（60 ml），並且將產物用乙酸乙酯（3 × 60 ml）萃取。將合併的有機層經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在乙酸乙酯中的0-10%甲醇）純化得到所需產物（2.47 g）。LCMS（方法1）：405 (M+H)⁺，Rt 0.94 min。

步驟3：1-[5-乙基氫硫基-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-吡啶-6-基]吡啶-1-鎊-3-基]環丙烷甲腈（中間體I-30）的製備

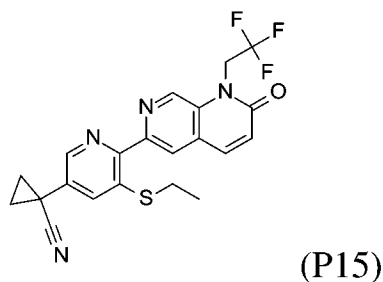


(I-30)

【0484】 向1-[5-氟-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-吡啶-6-基]吡啶-1-鎊-3-基]環丙烷甲腈（如上所述製備的中間體I-29，2.47 g，6.11 mmol）在N,N-二甲基甲醯胺（15 ml）中的溶液中添加乙硫醇鈉（771 mg，9.16 mmol）。將反應混合物在室溫下攪拌2小時，然後添加冰冷的水（100 ml），並且將產物用乙酸乙酯（3 × 100 ml）萃取三次。將合併的有機層用水和鹽水洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在乙酸乙酯中的0至10%甲醇）純化得到呈固體的所需產物（1.77 g），mp：231°C-232°C。LCMS（方法1）：447 (M+H)⁺，Rt 0.99 min。

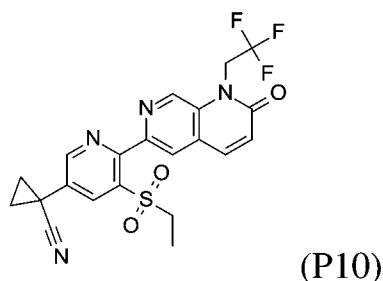
步驟4：1-[5-乙基氫硫基-6-[2-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-吡啶-6-基]-3-吡

啖基]環丙烷甲腈（化合物P15）的製備



【0485】 向1-[5-乙基氫硫基-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-啖啖-6-基]吡啖-1-鎊-3-基]環丙烷甲腈（如上所述製備的中間體I-30，1.77 g，3.96 mmol）在乾燥的乙腈（35.4 ml）中的溶液中添加4,4,5,5-四甲基-2-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜環戊硼烷-2-基)-1,3,2-二氧雜環戊硼烷（1.51 g，5.94 mmol）。將混合物在70°C下攪拌3小時，並在60°C下攪拌12小時。在用水（100 ml）稀釋後，將產物用乙酸乙酯（3 × 100 ml）萃取，將合併的有機層用鹽水（50 ml）洗滌、經無水硫酸鈉乾燥並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的梯度0至40%乙酸乙酯）純化得到呈灰白色固體的所需產物（1.09 g）。LCMS（方法1）：431 (M+H)⁺，Rt 1.10 min。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.38 (t, 3 H) 1.52 - 1.58 (m, 2 H) 1.85 - 1.90 (m, 2 H) 2.98 (q, 2 H) 5.08 (br d, 2 H) 6.95 (d, 1 H) 7.71 (d, 1 H) 7.81 (d, 1 H) 8.24 - 8.30 (m, 2 H) 8.94 (s, 1 H)。

步驟5：1-[5-乙基磺醯基-6-[2-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-啖啖-6-基]-3-吡啖基]環丙烷甲腈（化合物P10）的製備

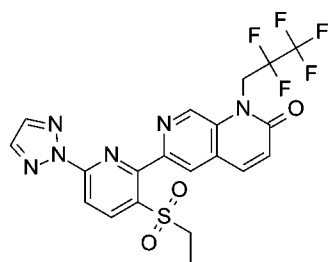


【0486】 向在0°C下的1-[5-乙基氫硫基-6-[2-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-啖啖-6-基]-3-吡啖基]環丙烷甲腈（如上所述製備的化合物P15，350 mg，0.813 mmol）在乙腈（7 ml）中的溶液中添加3-氯過氧苯甲酸（70%，441 mg，1.79 mmol）。

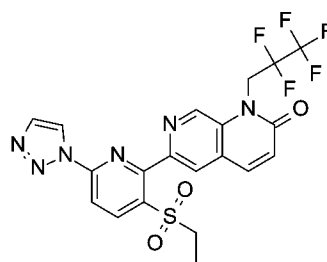
將混合物在室溫下攪拌2小時，然後添加冰冷的水（20 ml），並用2 N氫氧化鈉水溶液（20 ml）鹼化所述溶液。將產物用乙酸乙酯（3 × 20 ml）萃取，將合併的有機層用鹽水（20 ml）洗滌、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並減壓濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析法（在環己烷中的梯度0至80%乙酸乙酯）純化得到呈無色固體的所需產物（294 mg），mp：225°C-226°C。LCMS（方法1）：463 (M+H)⁺，Rt 1.03 min。

【0487】 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.43 (t, 3 H) 1.60 - 1.65 (m, 2 H) 1.95 - 2.00 (m, 2 H) 3.99 (q, 2 H) 5.09 (br d, 2 H) 6.98 (d, 1 H) 7.82 (d, 1 H) 8.09 (s, 1 H) 8.25 (d, 1 H) 8.81 (s, 1 H) 8.97 (d, 1 H)。

【0488】 實例H10：6-[3-乙基磺醯基-6-(三唑-2-基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噁啶-2-酮（化合物P11）和6-[3-乙基磺醯基-6-(三唑-1-基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噁啶-2-酮（化合物P12）的製備



(P11)



(P12)

【0489】 向6-(6-氯-3-乙基磺醯基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噁啶-2-酮（如上所述製備的中間體I-15，400 mg，0.83 mmol）在乙腈（4 ml）中的溶液中添加2H-三唑（86 mg，1.25 mmol）和碳酸鉀（172 mg，1.25 mmol）。將反應混合物在90°C下攪拌1小時，然後用水（50 ml）稀釋，並濾出沈澱的產物。藉由反相管柱層析法純化粗材料使兩種異構物分離。

【0490】 化合物P11：LCMS（方法1）：515 (M+H)⁺，Rt 1.08 min。

【0491】 ¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 1.32 (t, *J* = 7.40 Hz, 3 H) 4.05 (q, *J* = 7.40 Hz, 2 H) 5.47 (m, 2 H) 7.08 (d, *J* = 9.6 Hz, 1 H) 8.12 (d, *J* = 1.35 Hz, 1 H) 8.21 (d, *J* = 9.6 Hz, 1 H) 8.45 (d, *J* = 8.56 Hz, 1 H) 8.48 (s, 1 H) 8.75 (d, *J* = 8.56 Hz,

1 H) 9.12 (d, $J = 1.34$ Hz, 1 H) 9.17 (s, 1 H)。

【0492】 化合物P12：LCMS（方法1）：515 (M+H)⁺，Rt 1.07 min。

【0493】 ¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 1.30 (t, $J = 7.40$ Hz, 3 H) 3.99 (q, $J = 7.40$ Hz, 2 H) 5.47 (m, 2 H) 7.07 (d, $J = 9.7$ Hz, 1 H) 8.29 (d, $J = 9.7$ Hz, 1 H) 8.30 (s, 1 H) 8.34 (br s, 2 H), 8.36 (d, $J = 8.68$ Hz, 1 H) 8.70 (d, $J = 8.68$ Hz, 1 H) 9.16 (s, 1 H)。

[表P]：具有式 (I) 之化合物的實例

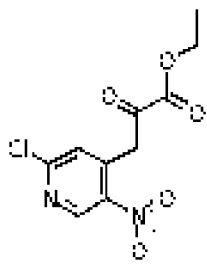
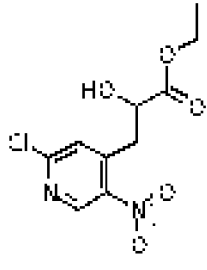
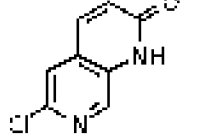
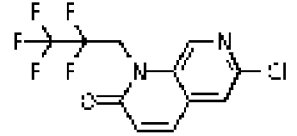
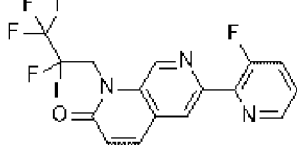
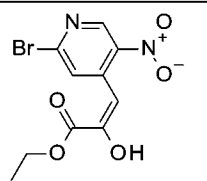
編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法	
P1	6-(3-乙基氫硫基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-2-酮		1.07	416	1	---
P2	6-(3-乙基磺醯基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-2-酮		0.97	448	1	217 - 219
P3	1-[5-乙基磺醯基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-6-基]-3-吡啶基]環丙烷甲腈		1.07	513	1	224 - 226
P4	6-[3-乙基磺醯基-6-(1,2,4-三唑-1-基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-2-酮		1.07	515	1	314 - 316
P5	6-(6-環丙基-3-乙基磺醯基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-2-酮		1.16	488	1	212 - 214

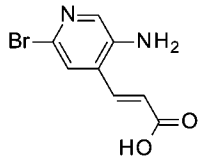
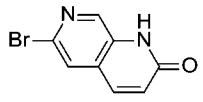
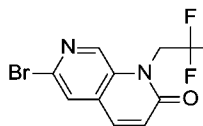
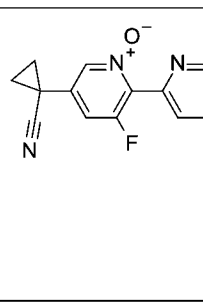
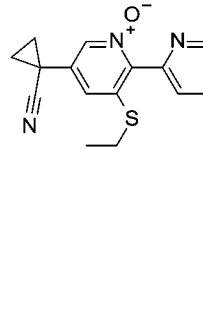
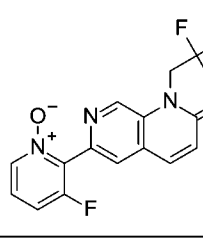
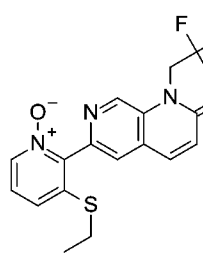
編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法	
P6	2-[5-乙基磺醯基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-6-基]-3-吡啶基]-2-甲基-丙腈		1.02	515	1	245 - 247
P7	N-[5-乙基磺醯基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-6-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙醯胺		0.99	519	1	280 - 282
P8	6-[5-(3-氯吡唑-1-基)-3-乙基磺醯基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-2-酮		1.13	548/550	1	277 - 278
P9	6-[3-乙基磺醯基-5-(2-吡啶基氧基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-2-酮		1.11	541	1	216 - 218
P10	1-[5-乙基磺醯基-6-[2-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-噻啉-6-基]-3-吡啶基]環丙烷甲腈		1.03	463	1	225 - 226
P11	6-[3-乙基磺醯基-6-(三唑-2-基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啉-2-酮		1.08	515	1	301 - 302

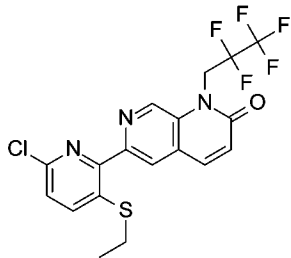
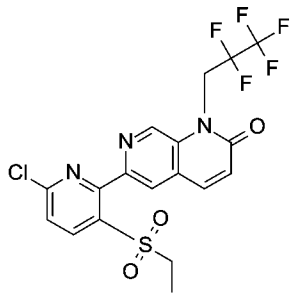
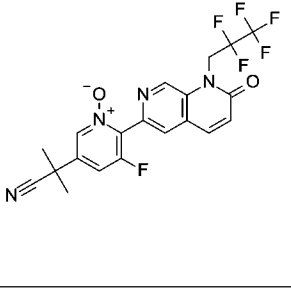
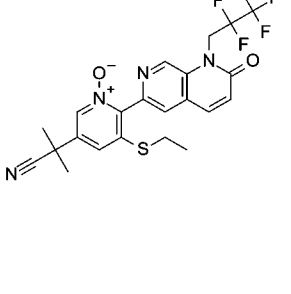
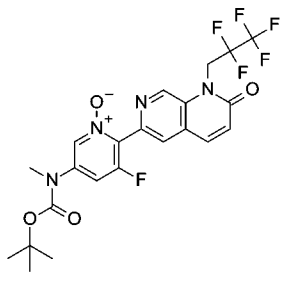
編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法	
P12	6-[3-乙基磺醯基-6-(三唑-1-基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮		1.07	515	1	294 - 296
P13	1-[5-乙基氫硫基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-6-基]-3-吡啶基]環丙烷甲腈		1.12	481	1	188 - 190
P14	6-[5-(3-氯吡唑-1-基)-3-乙基氫硫基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮		1.20	516/518	1	231 - 232
P15	1-[5-乙基氫硫基-6-[2-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-吡啶-6-基]-3-吡啶基]環丙烷甲腈		1.10	431	1	208 - 209
P16	6-[3-乙基氫硫基-5-(2-吡啶基氧基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮		1.17	509	1	---
P17	2-[5-乙基氫硫基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-6-基]-3-吡啶基]-2-		1.11	484	1	---

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法	
	甲基-丙腈					

[表I]：中間體的實例

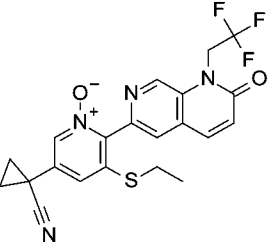
編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法	
I-1	3-(2-氯-5-硝基-4-吡啶基)-2-側氧基-丙酸乙酯		0.99	273	1	---
I-2	3-(2-氯-5-硝基-4-吡啶基)-2-羥基-丙酸乙酯		0.89	275	1	---
I-3	6-氯-1H-1,7-吡啶-2-酮		0.38	181	1	---
I-4	6-氯-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮		1.03	313	1	---
I-5	6-(3-氟-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮		0.97	374	1	---
I-6	(E)-3-(2-溴-5-硝基-4-吡啶基)-2-羥基-丙-2-烯酸酯		0.91	315/317 [M-H] ⁻	1	---

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法	
I-7	(E)-3-(5-胺基-2-溴-4-吡啶基)丙-2-烯酸		0.20	243/245	1	---
I-8	6-溴-1H-1,7-吡啶-2-酮		0.82	225/227	1	---
I-9	6-溴-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮		1.00	357/359	1	---
I-10	1-[5-氟-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-6-基]吡啶-1-鎊-3-基]環丙烷甲腈		0.99	455	1	---
I-11	1-[5-乙基氫硫基-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-6-基]吡啶-1-鎊-3-基]環丙烷甲腈		1.01	497	1	---
I-12	6-(3-氟-1-氧負離子基-吡啶-1-鎊-2-基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮		0.94	390	1	---
I-13	6-(3-乙基氫硫基-1-氧負離子基-吡啶-1-鎊-2-基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-吡啶-2-酮		0.77	432	1	---

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法	
I-14	6-(6-氯-3-乙基氫硫基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啟-2-酮		1.18	451	1	---
I-15	6-(6-氯-3-乙基磺醯基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啟-2-酮		1.10	483	1	---
I-16	2-[5-氟-1-氧負離子基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啟-6-基]吡啶-1-鎗-3-基]-2-甲基-丙腈		0.90	457	1	---
I-17	2-[5-乙基氫硫基-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啟-6-基]吡啶-1-鎗-3-基]-2-甲基-丙腈		0.93	499	1	---
I-18	N-[5-氟-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啟-6-基]吡啶-1-鎗-3-基]-N-甲基-胺基甲酸三級丁基酯		1.04	519	1	---

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法	
I-19	N-[5-乙基氫硫基-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啶-6-基]吡啶-1-鎊-3-基]-N-甲基-胺基甲酸三級丁基酯		1.10	561	1	---
I-20	N-[5-乙基氫硫基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啶-6-基]-3-吡啶基]-N-甲基-胺基甲酸三級丁基酯		1.24	545	1	172-174
I-21	N-[5-乙基磺醯基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啶-6-基]-3-吡啶基]-N-甲基-胺基甲酸三級丁基酯		1.13	577	1	196-198
I-22	6-[3-乙基磺醯基-5-(甲基胺基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-啉啶-2-酮		1.04	477	1	224-226
I-23	(3-氯吡啶-1-基)-5-氟-1-氧負離子基-吡啶-1-鎊		0.58	214/216	1	---

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法	
I-24	6-[5-(3-氯吡唑-1-基)-3-氟-1-氧負離子基-吡啶-1-鎊-2-基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-喹啉-2-酮		1.07	490/492	1	---
I-25	6-[5-(3-氯吡唑-1-基)-3-氟-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-喹啉-2-酮		1.11	474/476	1	---
I-26	6-[3-氟-1-氧負離子基-5-(2-吡啶基氧基)吡啶-1-鎊-2-基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-喹啉-2-酮		1.00	483	1	---
I-27	6-[3-乙基氫硫基-1-氧負離子基-5-(2-吡啶基氧基)吡啶-1-鎊-2-基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-喹啉-2-酮		1.03	525	1	---
I-28	6-溴-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-喹啉-2-酮		¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 5.00 (br d, 2 H) 6.95 (d, 1 H) 7.62 - 7.68 (m, 2 H) 8.58 (s, 1 H)。			
I-29	1-[5-氟-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-喹啉-6-基]吡啶-1-鎊-3-基]環丙烷甲腈		0.94	405	1	

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法	
I-30	1-[5-乙基氫硫基-1-氧負離子基-6-[2-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-噻啶-6-基]吡啶-1-鎊-3-基]環丙烷甲腈		0.99	447	1	231-232

【0494】 藉由添加其他殺昆蟲、殺蟎和/或殺真菌活性的成分，根據本發明的組成物的活性可以顯著地加寬，並且適合於普遍情況。具有式I之化合物與其他殺昆蟲、殺蟎和/或殺真菌活性的成分的混合物還可以具有另外的出人意料的優點，該等優點還可以在更寬的意義上描述為協同活性。例如，植物的更好的耐受性、降低的植物毒性、昆蟲可以在它們的不同發育階段得到控制、或者在它們的生產期間（例如，在研磨或者混合期間，在它們的儲存期間或它們的使用期間）的更好的行為。

【0495】 在這裡，適當添加的活性成分係例如以下類別的活性成分的代表：有機磷化合物、硝基苯酚衍生物、硫脲、保幼激素、甲脒、二苯甲酮衍生物、脲類、吡咯衍生物、胺基甲酸酯、擬除蟲菊酯、氯化烴、醯基脲、吡啶基亞甲基胺基衍生物、巨環內酯類、新菸鹼以及蘇雲金芽孢桿菌製劑。

【0496】 具有式I之化合物與活性成分的以下混合物係較佳的（縮寫「TX」意指「選自由以下組成之群組的一種化合物：描述於表A-1至A-60和表B-1至B-60和表P中的本發明的化合物」）：

【0497】 佐劑，該佐劑選自由以下組成的物質組：石油（別名）（628）+ TX，

【0498】 昆蟲控制活性物質，該昆蟲控制活性物質選自阿巴美丁 + TX、

滅蟎醃 + TX、啖蟲脒 + TX、乙醃蟲脒 + TX、氟丙菊酯 + TX、Acynonapyr + TX、雙丙環蟲酯 + TX、阿福拉納 + TX、棉鈴威 + TX、丙烯除蟲菊酯 + TX、 α -氯氰菊酯 + TX、甲體氯氰菊酯 + TX、磺胺蟎酯 + TX、滅害威 + TX、三唑錫 + TX、殺蟲磺 + TX、苯蟎特 + TX、Benzpyrimoxan + TX、 β -氟氯氰菊酯 + TX、 β -氯氰菊酯 + TX、聯苯肼酯 + TX、聯苯菊酯 + TX、樂殺蟎 + TX、生物烯丙菊酯 + TX、生物烯丙菊酯S)-環戊基異構物 + TX、生物苄呋菊酯 + TX、雙三氟蟲脒 + TX、溴蟲氟苯雙醃胺 (Broflanilide) + TX、溴氟菊酯 + TX、溴硫磷-乙基 + TX、噻吡酮 + TX、丁酮威 + TX、硫線磷 + TX、西維因 + TX、丁硫克百威 + TX、巴丹 + TX、CAS號：1632218-00-8 + TX、CAS號：1808115-49-2 + TX、CAS號：2032403-97-5 + TX、CAS號：2044701-44-0 + TX、CAS號：2128706-05-6 + TX、CAS號：2246757-58-2 (或2249718-27-0) + TX、CAS號：907187-07-9 + TX、氯蟲苯甲醃胺 + TX、氯丹 + TX、溴蟲脒 + TX、氯炔丙菊酯 + TX、環蟲醃肼 + TX、克侖吡林 + TX、除線威 + TX、噻蟲胺 + TX、2-氯苯基N-甲基胺基甲酸酯 (CPMC) + TX、苯腈磷 + TX、溴氯蟲醃胺 + TX、環溴蟲醃胺 + TX、Cyclobutrifluram + TX、擬除蟲菊酯 + TX、環氧蟲啖 + TX、腈吡蟎酯 + TX、乙唑蟎脒 (Cyetpyrafen) + TX、丁氟蟎酯 + TX、氟氯氰菊酯 + TX、氯氟氯蟲醃胺 (cyhalodiamide) + TX、三氟氯氰菊酯 + TX、氯氰菊酯 + TX、苯氰菊酯 + TX、Cyproflanilide + TX、滅蠅胺 + TX、溴氰菊酯 + TX、殺蟎隆 + TX、氯亞胺硫磷 + TX、二溴磷 (Dibrom) + TX、Dicloromezotiaz + TX、氟蟎吡 + TX、除蟲脒 + TX、dimpropyridaz + TX、二活菌素 + TX、敵蟎普 + TX、呋蟲胺 + TX、蔬果磷 + TX、艾瑪菌素 (或艾瑪菌素苯甲酸鹽) + TX、右旋烯炔菊酯 + TX、 ϵ -momfluorothrin + TX、 ϵ -甲氧苄氟菊酯 + TX、高氯戊菊酯 + TX、乙硫磷 + TX、乙蟲脒 + TX、醚菊酯 + TX、乙蟎啖 + TX、伐滅磷 + TX、啞蟎醚 + TX、五氟苯菊酯 + TX、殺螟硫磷 + TX、仲丁威 (Fenobucarb)

+ TX、苯硫威 + TX、苯氧威 + TX、甲氰菊酯 + TX、啞蟎酯 (Fenpyroximate)
 + TX、豐索磷 + TX、倍硫磷 + TX、葉塞靈 + TX、氰戊菊酯 + TX、氟蟲腓 +
 TX、氟麥托醌 (Flometoquin) + TX、氟啶蟲醯胺 + TX、啞蟎酯 + TX、
 Fluazaindolizine + TX、啞蟎脲 + TX、氟蟲雙醯胺 + TX、氟蟎噻 + TX、Flucitrinate
 + TX、氟蟎脲 + TX、氟氰戊菊酯 + TX、氟噻蟲砒 + TX、啞蟲胺 + TX、三氟
 醚菊酯 + TX、丁烯氟蟲腓 + TX、氟己芬 (Fluhexafon) + TX、氟氯苯菊酯 +
 TX、氟吡菌醯胺 + TX、Flupentiofenox + TX、氟吡呋喃酮 + TX、Flupyrimin +
 TX、氟雷拉納 (fluralaner) + TX、氟胺氰菊酯 + TX、Fluxametamide + TX、噻
 啞磷 + TX、 γ -三氟氯氰菊酯 + TX、Gossyplure™ + TX、戊吡蟲胍 + TX、氯蟲
 醯肼 + TX、苜蟎醚 (halofenprox) + TX、Heptafluthrin + TX、噻蟎酮 + TX、氟
 蟻脲 + TX、咪啞環磷 (Imicyafos) + TX、吡蟲啉 + TX、炔咪菊酯 + TX、茚蟲
 威 + TX、碘甲烷 + TX、異菌脲 + TX、Isocycloseram + TX、異拌磷 + TX、
 伊維菌素 + TX、 κ -聯苯菊酯 + TX、 κ -七氟菊酯 + TX、 λ -三氟氯氰菊酯 + TX、
 雷皮菌素 + TX、氯芬奴隆 + TX、氰氟蟲脲 + TX、四聚乙醛 + TX、威百畝 +
 TX、滅多蟲 + TX、甲氧蟲醯肼 + TX、甲氧苄氟菊酯 + TX、速滅威 + TX、自
 克威 + TX、滅蟎菌素 + TX、Momfluorothrin + TX、滅條靈 + TX、Nicofluprole
 + TX、烯啞蟲胺 + TX、硝蟲噻吡 + TX、氧樂果 + TX、殺線威 + TX、Oxazosulfyl
 + TX、對硫磷-乙基 + TX、苄氯菊酯 + TX、苯醚菊酯 + TX、磷蟲威 + TX、胡
 椒基丁醚 + TX、抗蚜威 + TX、啞啞磷-乙基 + TX、啞啞磷-甲基 + TX、多角
 體病毒 + TX、炔丙菊酯 + TX、丙溴磷 + TX、丙溴磷 + TX、丙氟菊酯 + TX、
 克蟎特 + TX、胺丙畏 + TX、殘殺威 + TX、丙硫磷 + TX、丙苯煙菊酯
 (Protrifenbute) + TX、吡氟丁醯胺 (pyflubumide) + TX、吡蚜酮 + TX、吡啞
 硫磷 + TX、啞啞啞蟲胺 (Pyrafluprole) + TX、噻蟎靈 + TX、啞蟲丙醚 + TX、
 氟蟲吡啞 (pyrifluquinazon) + TX、啞蟎醚 + TX、Pyrimostrobin + TX、吡啞蟲

啶 + TX、蚊蠅醚 + TX、苜呋菊脂 + TX、Sarolaner + TX、司拉克丁 + TX、氟
 矽菊酯 + TX、乙基多殺菌素 + TX、多殺菌素 + TX、螺蟻酯 + TX、螺甲蟻酯
 + TX、Spiropidion + TX、螺蟲乙酯 + TX、虱蟲啉 + TX、蟲醯肼 + TX、吡蟻胺
 + TX、丁基嘧啶磷 (Tebupirimiphos) + TX、七氟菊酯 + TX、雙硫磷 + TX、
 Tetrachloraniliprole + TX、四氯殺蟻虱 (tetradiphon) + TX、胺菊酯 + TX、四氟
 醚菊酯 + TX、殺蟻素 + TX、氟氰蟲醯胺 + TX、 θ -氯氰菊酯 + TX、噻蟲啉 +
 TX、噻蟲吡 + TX、殺蟲環 + TX、硫雙威 + TX、久效威 + TX、甲基乙拌磷 +
 TX、殺蟲單 + TX、Tioxazafen + TX、啞蟲醯胺 + TX、毒殺芬 + TX、四溴菊酯
 + TX、四氟苯菊酯 + TX、啞蚜威 + TX、三啞磷 + TX、敵百蟲 + TX、毒壤磷
 + TX、敵百蟲 + TX、三氟苯嘧啶 (triflumezopyrim) + TX、Tyclopyrazoflor + TX、
 ζ -氯氰菊酯 + TX、海藻萃取物和衍生自糖蜜的發酵產物 + TX、海藻萃取物和衍
 生自糖蜜的發酵產物 (包含脲 + TX、胺基酸 + TX、鉀和鋁以及EDTA螯合錳)
 + TX、海藻萃取物和發酵的植物產物 + TX、海藻萃取物和發酵的植物產物 (包
 含植物激素 + TX, 維生素 + TX, EDTA螯合銅 + TX、鋅 + TX、以及鐵) + TX、
 印棟素 + TX、芽孢桿菌屬鯨澤 (*Bacillus aizawai*) + TX、蝕幾丁質芽孢桿菌屬
 (*Bacillus chitosporus*) AQ746 (NRRL登記號B-21 618) + TX、堅強芽孢桿菌
 + TX、芽孢桿菌庫爾斯塔克 (*Bacillus kurstaki*) + TX、蕈狀芽孢桿菌 AQ726
 (NRRL登記號B-21664) + TX、短小芽孢桿菌 (NRRL登記號B-30087) + TX、
 短小芽孢桿菌AQ717 (NRRL登記號B-21662) + TX、芽孢桿菌屬物種AQ178
 (ATCC登記號53522) + TX、芽孢桿菌屬物種AQ175 (ATCC登記號55608) + TX、
 芽孢桿菌屬物種AQ177 (ATCC登記號55609) + TX、未指明的枯草芽孢桿菌 +
 TX、枯草芽孢桿菌AQ153 (ATCC登記號55614) + TX、枯草芽孢桿菌AQ30002
 (NRRL登記號B-50421) + TX、枯草芽孢桿菌AQ30004 (NRRL登記號B- 50455)
 + TX、枯草芽孢桿菌AQ713 (NRRL登記號B-21661) + TX、枯草芽孢桿菌AQ743

(NRRL登記號B-21665) + TX、蘇雲金芽孢桿菌AQ52 (NRRL登記號B-21619) + TX、蘇雲金芽孢桿菌BD#32 (NRRL登記號B-21530) + TX、蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克亞種 (subspec. kurstaki) BMP 123 + TX、球孢白僵菌 + TX、D-檸檬烯 + TX、顆粒體病毒 + TX、康壯素 (Harpin) + TX、棉鈴蟲核型多角體病毒 + TX、穀實夜蛾核型多角體病毒 + TX、煙芽夜蛾核型多角體病毒 + TX、澳洲棉鈴蟲核型多角體病毒 + TX、綠僵菌屬物種 + TX、Muscodor albus 620 (NRRL登記號30547) + TX、Muscodor roseus A3-5 (NRRL登記號30548) + TX、基於印楝樹的產品 + TX、玫煙色擬青黴 + TX、淡紫色擬青黴 + TX、擬斯紮瓦巴氏桿菌 + TX、穿刺巴氏桿菌 + TX、分枝巴氏桿菌 + TX、索雷巴氏桿菌 (Pasteuria thornei) + TX、巴氏桿菌 + TX、對-傘花煙 + TX、小菜蛾顆粒體病毒 + TX、小菜蛾核型多角體病毒 + TX、多角體病毒 + TX、除蟲菊 + TX、QRD 420 (類萆摻混物) + TX、QRD 452 (類萆摻混物) + TX、QRD 460 (類萆摻混物) + TX、皂樹 + TX、球狀紅球菌AQ719 (NRRL登記號B-21663) + TX、草地貪夜蛾核型多角體病毒 + TX、鮮黃鏈黴菌 (NRRL登記號30232) + TX、鏈黴菌屬物種 (NRRL登記號B-30145) + TX、類萆摻混物 + TX、以及輪枝孢屬物種，

【0499】 殺藻劑，該殺藻劑選自由以下組成的物質組：百殺辛 (bethoxazin) [CCN] + TX、二辛酸銅 (IUPAC名稱) (170) + TX、硫酸銅 (172) + TX、cybutryne [CCN] + TX、二氯萘醌 (dichlone) (1052) + TX、雙氯酚 (232) + TX、菌多酸 (295) + TX、三苯錫 (fentin) (347) + TX、熟石灰 [CCN] + TX、代森鈉 (nabam) (566) + TX、滅藻醌 (quinoclamine) (714) + TX、醌苳胺 (quinonamid) (1379) + TX、西瑪津 (730) + TX、三苯基乙酸錫 (IUPAC名稱) (347) 和三苯基氫氧化錫 (IUPAC名稱) (347) + TX，

【0500】 驅蠕蟲劑，該驅蠕蟲劑選自由以下組成的物質組：阿巴美丁 (1) + TX、克蘆磷酯 (1011) + TX、Cyclobutrifluram + TX、朵拉克汀 (別名) [CCN]

+ TX、依馬克丁 (291) + TX、依馬克丁苯甲酸酯 (291) + TX、依立諾克丁 (別名) [CCN] + TX、伊維菌素 (別名) [CCN] + TX、米爾貝肟 (別名) [CCN] + TX、莫昔克丁 (別名) [CCN] + TX、哌吡 [CCN] + TX、塞拉菌素 (selamectin) (別名) [CCN] + TX、多殺菌素 (737) 和托布津 (thiophanate) (1435) + TX，

【0501】 殺鳥劑，該殺鳥劑選自由以下組成的物質組：氯醛糖 (127) + TX、異狄氏劑 (1122) + TX、倍硫磷 (346) + TX、吡啶-4-胺 (IUPAC名稱) (23) 和土的寧 (745) + TX，

【0502】 殺細菌劑，該殺細菌劑選自由以下組成的物質組：1-羥基-1*H*-吡啶-2-硫酮 (IUPAC名稱) (1222) + TX、4-(喹啉-2-基胺基)苯磺醯胺 (IUPAC名稱) (748) + TX、8-羥基喹啉硫酸鹽 (446) + TX、溴硝醇 (97) + TX、二辛酸銅 (IUPAC名稱) (170) + TX、氫氧化銅 (IUPAC名稱) (169) + TX、甲酚 [CCN] + TX、雙氯酚 (232) + TX、雙吡硫翁 (1105) + TX、多地辛 (1112) + TX、敵磺鈉 (fenaminosulf) (1144) + TX、甲醛 (404) + TX、汞加芬 (別名) [CCN] + TX、春雷黴素 (483) + TX、春雷黴素鹽酸鹽水合物 (483) + TX、二(二甲基二硫代胺基甲酸)鎳 (IUPAC名稱) (1308) + TX、三氯甲基吡啶 (nitrapyrin) (580) + TX、辛噻酮 (octhilinone) (590) + TX、奧索利酸 (606) + TX、土黴素 (611) + TX、羥基喹啉硫酸鉀 (446) + TX、噻菌靈 (probenazole) (658) + TX、鏈黴素 (744) + TX、鏈黴素倍半硫酸鹽 (744) + TX、葉枯酞 (766) + TX、和硫柳汞 (別名) [CCN] + TX，

【0503】 生物製劑，該生物製劑選自由以下組成的物質組：棉褐帶卷蛾顆粒體病毒 (*Adoxophyes orana* GV) (別名) (12) + TX、放射形土壤桿菌 (別名) (13) + TX、鈍綫蟎屬物種 (*Amblyseius* spp.) (別名) (19) + TX、芹菜夜蛾核多角體病毒 (*Anagrapha falcifera* NPV) (別名) (28) + TX、*Anagrus atomus* (別名) (29) + TX、短距蚜小蜂 (*Aphelinus abdominalis*) (別名) (33) + TX、棉蚜

寄生蜂(*Aphidius colemani*)(別名)(34)+TX、食蚜癭蚊(*Aphidoletes aphidimyza*)(別名)(35)+TX、苜蓿銀紋夜蛾核多角體病毒(*Autographa californica* NPV)(別名)(38)+TX、堅硬芽孢桿菌(*Bacillus firmus*)(別名)(48)+TX、球形芽孢桿菌(*Bacillus sphaericus* Neide)(學名)(49)+TX、蘇雲金芽孢桿菌(*Bacillus thuringiensis* Berliner)(學名)(51)+TX、蘇雲金芽孢桿菌鯰澤亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*)(學名)(51)+TX、蘇雲金芽孢桿菌以色列亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*)(學名)(51)+TX、蘇雲金芽孢桿菌日本亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis*)(學名)(51)+TX、蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*)(學名)(51)+TX、蘇雲金芽孢桿菌擬步行甲亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*)(學名)(51)+TX、球孢白僵菌(*Beauveria bassiana*)(別名)(53)+TX、布氏白僵菌(*Beauveria brongniartii*)(別名)(54)+TX、草蜻蛉(*Chrysoperla carnea*)(別名)(151)+TX、孟氏隱唇瓢蟲(*Cryptolaemus montrouzieri*)(別名)(178)+TX、蘋果蠹蛾顆粒體病毒(*Cydia pomonella* GV)(別名)(191)+TX、西伯利亞離顎繭蜂(*Dacnusa sibirica*)(別名)(212)+TX、豌豆潛葉蠅姬小蜂(*Diglyphus isaea*)(別名)(254)+TX、麗蚜小蜂(*Encarsia formosa*)(學名)(293)+TX、槲角蚜小蜂(*Eretmocerus eremicus*)(別名)(300)+TX、玉米穗夜蛾核多角體病毒(*Helicoverpa zea* NPV)(別名)(431)+TX、嗜菌異小桿線蟲(*Heterorhabditis bacteriophora*)和*H. megidis*(別名)(433)+TX、會聚長足瓢蟲(*Hippodamia convergens*)(別名)(442)+TX、橘粉介殼蟲寄生蜂(*Leptomastix dactylopii*)(別名)(488)+TX、盲蝽(*Macrolophus caliginosus*)(別名)(491)+TX、甘藍夜蛾核多角體病毒(*Mamestra brassicae* NPV)(別名)(494)+TX、*Metaphycus helvolus*(別名)(522)+TX、黃綠綠僵菌(*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*)(學名)(523)+TX、金龜子綠僵菌小孢變種(*Metarhizium anisopliae* var.

anisopliae) (學名) (523) + TX、松黃葉蜂 (*Neodiprion sertifer*) 核多角體病毒和紅頭松樹葉蜂 (*N. lecontei*) 核多角體病毒 (別名) (575) + TX、小花蝽屬物種 (別名) (596) + TX、玫菸色擬青黴 (*Paecilomyces fumosoroseus*) (別名) (613) + TX、智利捕植蟎 (*Phytoseiulus persimilis*) (別名) (644) + TX、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua multicapsid*) 多核衣殼核多角體病毒 (學名) (741) + TX、毛蚊線蟲 (*Steinernema bibionis*) (別名) (742) + TX、小卷蛾斯氏線蟲 (*Steinernema carpocapsae*) (別名) (742) + TX、夜蛾斯氏線蟲 (別名) (742) + TX、格氏線蟲 (*Steinernema glaseri*) (別名) (742) + TX、銳比斯氏線蟲 (*Steinernema riobrave*) (別名) (742) + TX、*Steinernema riobravise* (別名) (742) + TX、螻蛄斯氏線蟲 (*Steinernema scapterisci*) (別名) (742) + TX、斯氏線蟲屬物種 (*Steinernema* spp.) (別名) (742) + TX、赤眼蜂屬物種 (別名) (826) + TX、西方盲走蟎 (*Typhlodromus occidentalis*) (別名) (844) 和蠟蚧輪枝菌 (*Verticillium lecanii*) (別名) (848) + TX，

【0504】 土壤消毒劑，該土壤消毒劑選自由以下組成的物質組：碘甲烷 (IUPAC名稱) (542) 和溴甲烷 (537) + TX，

【0505】 化學滅菌劑，該化學滅菌劑選自由以下組成的物質組：啞磷吡 (apholate) [CCN] + TX、雙(氮丙啶)甲胺基磷硫化物 (bisazir) (別名) [CCN] + TX、白消安 (別名) [CCN] + TX、除蟲脲 (250) + TX、迪麥替夫 (dimatif) (別名) [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、甲基不育特 (methyl apholate) [CCN] + TX、不孕啶 (morzid) [CCN] + TX、氟幼脲 (penfluron) (別名) [CCN] + TX、涕巴 (tepa) [CCN] + TX、硫代六甲磷 (thiohempa) (別名) [CCN] + TX、硫涕巴 (別名) [CCN] + TX、曲他胺 (別名) [CCN] 和尿烷亞胺 (別名) [CCN] + TX，

【0506】 昆蟲資訊素，該昆蟲資訊素選自由以下組成的物質組：*(E)*-癸-5-烯-1-基乙酸酯與*(E)*-癸-5-烯-1-醇（IUPAC名稱）（222）+ TX、*(E)*-十三碳-4-烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（829）+ TX、*(E)*-6-甲基庚-2-烯-4-醇（IUPAC名稱）（541）+ TX、*(E,Z)*-十四碳-4,10-二烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（779）+ TX、*(Z)*-十二碳-7-烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（285）+ TX、*(Z)*-十六碳-11-烯醛（IUPAC名稱）（436）+ TX、*(Z)*-十六碳-11-烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（437）+ TX、*(Z)*-十六碳-13-烯-11-炔-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（438）+ TX、*(Z)*-二十-13-烯-10-酮（IUPAC名稱）（448）+ TX、*(Z)*-十四碳-7-烯-1-醛（IUPAC名稱）（782）+ TX、*(Z)*-十四碳-9-烯-1-醇（IUPAC名稱）（783）+ TX、*(Z)*-十四碳-9-烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（784）+ TX、*(7E,9Z)*-十二碳-7,9-二烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（283）+ TX、*(9Z,11E)*-十四碳-9,11-二烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（780）+ TX、*(9Z,12E)*-十四碳-9,12-二烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（781）+ TX、14-甲基十八碳-1-烯（IUPAC名稱）（545）+ TX、4-甲基壬-5-醇與4-甲基壬-5-酮（IUPAC名稱）（544）+ TX、 α -多紋素（alpha-multistriatin）（別名）[CCN] + TX、西部松小蠹集合資訊素（brevicomins）（別名）[CCN] + TX、十二碳二烯醇（codlelure）（別名）[CCN] + TX、可得蒙（codlemone）（別名）（167）+ TX、誘蠅酮（cuelure）（別名）（179）+ TX、環氧十九烷（disparlure）（277）+ TX、十二碳-8-烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（286）+ TX、十二碳-9-烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（287）+ TX、十二碳-8 + TX、10-二烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（284）+ TX、dominicalure（別名）[CCN] + TX、4-甲基辛酸乙酯（IUPAC名稱）（317）+ TX、丁香酚（別名）[CCN] + TX、南部松小蠹集合資訊素（frontalin）（別名）[CCN] + TX、誘蟲十六酯（gossyplure）（別名）（420）+ TX、誘殺烯混劑（grandlure）（421）+ TX、誘殺烯混劑I（別名）（421）+ TX、誘殺烯混劑II（別名）（421）+ TX、誘殺烯混劑III（別名）（421）+ TX、誘殺烯混劑IV（別名）

(421) + TX、己誘劑 (hexalure) [CCN] + TX、齒小蠹二烯醇 (ipsdienol) (別名) [CCN] + TX、小蠹烯醇 (ipsenol) (別名) [CCN] + TX、金龜子性誘劑 (japonilure) (別名) (481) + TX、三甲基二氧三環壬烷 (別名) [CCN] + TX、litlure (別名) [CCN] + TX、粉紋夜蛾性誘劑 (looplure) (別名) [CCN] + TX、誘殺酯 (medlure) [CCN] + TX、megatomoic acid (別名) [CCN] + TX、誘蟲醚 (methyl eugenol) (別名) (540) + TX、誘蟲烯 (muscalure) (563) + TX、十八碳-2,13-二烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名稱) (588) + TX、十八碳-3,13-二烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名稱) (589) + TX、賀康彼 (orfralure) (別名) [CCN] + TX、椰蛀犀金龜聚集資訊素 (oryctalure) (別名) (317) + TX、非樂康 (ostramone) (別名) [CCN] + TX、誘蟲環 (siglure) [CCN] + TX、sordidin (別名) (736) + TX、食菌甲誘醇 (sulcatol) (別名) [CCN] + TX、十四碳-11-烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名稱) (785) + TX、地中海實蠅引誘劑 (839) + TX、地中海實蠅引誘劑A (別名) (839) + TX、地中海實蠅引誘劑B₁ (別名) (839) + TX、地中海實蠅引誘劑B₂ (別名) (839) + TX、地中海實蠅引誘劑C (別名) (839) 和trunc-call (別名) [CCN] + TX，

【0507】 昆蟲驅避劑，該昆蟲驅避劑選自由以下組成的物質組：2-(辛基硫代)乙醇 (IUPAC名稱) (591) + TX、避蚊酮 (butopyronoxyl) (933) + TX、丁氧基(聚丙二醇) (936) + TX、己二酸二丁酯 (IUPAC名稱) (1046) + TX、鄰苯二甲酸二丁酯 (1047) + TX、丁二酸二丁酯 (IUPAC名稱) (1048) + TX、避蚊胺 [CCN] + TX、驅蚊酯 (dimethyl carbate) [CCN] + TX、鄰苯二甲酸二甲酯 [CCN] + TX、乙基己二醇 (1137) + TX、己脲 [CCN] + TX、甲嗪丁 (methoquin-butyl) (1276) + TX、甲基新癸醯胺 [CCN] + TX、草醯胺酸酯 (oxamate) [CCN] 和羥哌酯 [CCN] + TX，

【0508】 殺軟體動物劑，該殺軟體動物劑選自由以下組成的物質組：二(三

丁基錫)氧化物 (IUPAC名稱) (913) + TX、溴乙醯胺[CCN] + TX、砷酸鈣[CCN] + TX、除線威 (cloethocarb) (999) + TX、乙醯亞砷酸銅[CCN] + TX、硫酸銅 (172) + TX、三苯錫 (347) + TX、磷酸鐵 (IUPAC名稱) (352) + TX、四聚乙醛 (518) + TX、滅蟲威 (530) + TX、氯硝柳胺 (576) + TX、氯硝柳胺-乙醇胺(576)+ TX、五氯酚(623)+ TX、五氯苯氧化鈉(623)+ TX、噻蟎威(tazimcarb) (1412)+ TX、硫雙威(799)+ TX、三丁基氧化錫(913)+ TX、蝸螺殺(trifenmorph) (1454) + TX、混殺威(trimethacarb) (840) + TX、三苯基乙酸錫 (IUPAC名稱) (347) 和三苯基氫氧化錫 (IUPAC名稱) (347) + TX、吡啶蟲啉 (pyriprole) [394730-71-3] + TX，

【0509】 殺線蟲劑，該殺線蟲劑選自由以下組成的物質組：AKD-3088 (化合物代碼) + TX、1,2-二溴-3-氯丙烷 (IUPAC/化學文摘名稱) (1045) + TX、1,2-二氯丙烷 (IUPAC/化學文摘名稱) (1062) + TX、1,2-二氯丙烷與1,3-二氯丙烯 (IUPAC名稱) (1063) + TX、1,3-二氯丙烯 (233) + TX、3,4-二氯四氫噻吩1,1-二氧化物 (IUPAC/化學文摘名稱) (1065) + TX、3-(4-氯苯基)-5-甲基玫瑰寧 (IUPAC名稱) (980) + TX、5-甲基-6-硫代-1,3,5-噻二吡咻 -3-基乙酸 (IUPAC名稱) (1286) + TX、6-異戊烯基胺基嘌呤 (別名) (210) + TX、阿巴美丁 (1) + TX、乙醯蟲脲[CCN]+TX、棉鈴威 (15) + TX、涕滅威 (aldicarb) (16) + TX、涕滅虱威 (863) + TX、AZ 60541 (化合物代碼) + TX、苯氯噻唑 (benclotiaz) [CCN] + TX、苯菌靈 (62) + TX、丁基噻蟎酮 (別名) + TX、硫線磷 (109) + TX、蟲蟎威 (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、除線威 (cloethocarb) (999) + TX、Cyclobutrifluram + TX、細胞分裂素 (別名) (210) + TX、棉隆 (216) + TX、DBCP (1045) + TX、DCIP (218) + TX、除線特 (diamidafos) (1044) + TX、除線磷 (1051) + TX、二克磷 (dicliphos) (別名) + TX、樂果 (262) + TX、朵拉菌素 (doramectin) (別

名) [CCN]+TX、依馬克丁 (291) +TX、依馬克丁苯甲酸鹽 (291) +TX、依立諾克丁 (別名) [CCN]+TX、滅線磷 (312) +TX、二溴化乙烯 (316) +TX、克線磷 (326) +TX、吡蟊胺 (fenpyrad) (別名) +TX、豐索磷 (1158) +TX、噻唑磷 (408) +TX、丁硫環磷 (1196) +TX、糠醛 (別名) [CCN]+TX、GY-81 (發展代碼) (423) +TX、速殺硫磷[CCN]+TX、碘甲烷 (IUPAC名稱) (542) +TX、艾沙米多福 (isamidofos) (1230) +TX、氯唑磷 (1231) +TX、伊佛黴素 (別名) [CCN]+TX、激動素 (別名) (210) +TX、甲基滅蚜磷 (1258) +TX、威百畝 (519) +TX、威百畝鉀鹽 (別名) (519) +TX、威百畝鈉鹽 (519) +TX、甲基溴 (537) +TX、甲基異硫氰酸酯 (543) +TX、米爾貝肟 (別名) [CCN]+TX、莫昔克丁 (別名) [CCN]+TX、疣孢漆斑菌 (*Myrothecium verrucaria*) 組成物 (別名) (565) +TX、NC-184 (化合物代碼) +TX、草胺醯 (602) +TX、甲拌磷 (636) +TX、磷胺 (639) +TX、磷蟲威[CCN]+TX、克線丹 (別名) +TX、司拉克丁 (別名) [CCN]+TX、多殺菌素 (737) +TX、叔丁威 (terbam) (別名) +TX、特丁磷 (773) +TX、四氯噻吩 (IUPAC/化學文摘名稱) (1422) +TX、thiafenox (別名) +TX、硫磷磷(1434)+TX、三唑磷(820)+TX、啞蚜威(別名)+TX、二甲苯酚[CCN]+TX、YI-5302 (化合物代碼) 和玉米素 (別名) (210) +TX、氟噻蟲磺 (fluensulfone) [318290-98-1]+TX、氟吡菌醯胺 + TX，

【0510】 硝化抑制劑，該硝化抑制劑選自由以下組成的物質組：乙基黃原酸鉀[CCN]以及氯啞 (nitrapyrin) (580) + TX，

【0511】 植物活化劑，該植物活化劑選自由以下組成的物質組：阿拉酸式苯 (acibenzolar) (6) + TX、阿拉酸式苯-S-甲基 (6) + TX、噻菌靈 (probenazole) (658) 和大虎杖 (*Reynoutria sachalinensis*) 萃取物 (別名) (720) + TX，

【0512】 殺鼠劑，該殺鼠劑選自由以下組成的物質組：2-異戊醯二氫萸-1,3-二酮 (IUPAC名稱) (1246) + TX、4-(啞啞啞-2-基胺基)苯磺醯胺 (IUPAC名

稱) (748) + TX、 α -氯代醇 [CCN] + TX、磷化鋁 (640) + TX、安妥 (880) + TX、三氧化二砷 (882) + TX、碳酸鋇 (891) + TX、雙鼠脲 (912) + TX、溴鼠隆 (89) + TX、溴敵隆 + TX、溴鼠胺 (92) + TX、氰化鈣 (444) + TX、氯醛糖 (127) + TX、氯鼠酮 (140) + TX、膽鈣化醇 (別名) (850) + TX、氯滅鼠靈 (1004) + TX、克滅鼠 (1005) + TX、殺鼠萘 (175) + TX、殺鼠嘧啶 (1009) + TX、鼠得克 (246) + TX、噻鼠靈 (249) + TX、敵鼠鈉 (273) + TX、鈣化醇 (301) + TX、氟鼠靈 (357) + TX、氟乙醯胺 (379) + TX、鼠樸定 (1183) + TX、鹽酸鼠樸定 (1183) + TX、 γ -HCH (430) + TX、HCH (430) + TX、氫氰酸 (444) + TX、碘甲烷 (IUPAC名稱) (542) + TX、林旦 (430) + TX、磷化鎂 (IUPAC名稱) (640) + TX、溴甲烷 (537) + TX、鼠特靈 (1318) + TX、毒鼠磷 (1336) + TX、磷化氫 (IUPAC名稱) (640) + TX、磷 [CCN] + TX、殺鼠酮 (1341) + TX、亞砷酸鉀 [CCN] + TX、滅鼠優 (1371) + TX、海蔥糖苷 (1390) + TX、亞砷酸鈉 [CCN] + TX、氰化鈉 (444) + TX、氟乙酸鈉 (735) + TX、士的寧 (745) + TX、硫酸銻 [CCN] + TX、殺鼠靈 (851) 以及磷化鋅 (640) + TX，

【0513】 增效劑，該增效劑選自由以下組成的物質組：2-(2-丁氧基乙氧基)乙基胡椒酸酯 (IUPAC名稱) (934) + TX、5-(1,3-苯并二氧雜環戊烯-5-基)-3-己基環己-2-烯酮 (IUPAC名稱) (903) + TX、具有橙花三級醇的茵綠烯醇 (別名) (324) + TX、MB-599 (發展代碼) (498) + TX、MGK 264 (發展代碼) (296) + TX、增效醚 (piperonyl butoxide) (649) + TX、增效醛 (piprotal) (1343) + TX、增效酯 (propyl isomer) (1358) + TX、S421 (發展代碼) (724) + TX、增效散 (sesamex) (1393) + TX、芝麻林素 (sesasmolin) (1394) 和亞砷 (1406) + TX，

【0514】 動物驅避劑，該動物驅避劑選自由以下組成的物質組：蔥醌 (32) + TX、氯醛糖 (127) + TX、環烷酸銅 [CCN] + TX、王銅 (171) + TX、二吡磷 (227) + TX、二環戊二烯 (化學名稱) (1069) + TX、雙胍辛鹽 (guazatine)

(422) + TX、雙胍辛醋酸鹽(422) + TX、滅蟲威(530) + TX、吡啶-4-胺(IUPAC名稱)(23) + TX、塞侖(804) + TX、混殺威(trimethacarb)(840) + TX、環烷酸鋅[CCN]和福美鋅(856) + TX，

【0515】 殺病毒劑，該殺病毒劑選自由以下組成的物質組：衣馬寧(別名)[CCN]和利巴韋林(別名)[CCN] + TX，

【0516】 創傷保護劑，該創傷保護劑選自由以下組成的物質組：氧化汞(512) + TX、辛噻酮(octhilinone)(590)和托布津(802) + TX，

【0517】 生物活性物質，該生物活性物質選自1,1-雙(4-氯苯基)-2-乙氧基乙醇 + TX、2,4-二氯苯基苯磺酸酯 + TX、2-氟-N-甲基-N-1-萘乙醯胺 + TX、4-氯苯基苯基砒 + TX、乙醯蟲脞 + TX、涕滅虱威 + TX、賽果 + TX、果滿磷 + TX、胺吸磷 + TX、草酸氫胺吸磷 + TX、雙甲脒 + TX、殺蟻特 + TX、三氧化二砷 + TX、偶氮苯 + TX、偶氮磷 + TX、苯菌靈 + TX、苯諾沙磷(benoxafos) + TX、苯甲酸苄酯 + TX、聯苯吡菌胺 + TX、溴滅菊酯 + TX、溴烯殺 + TX、溴硫磷 + TX、溴蟻酯 + TX、噻吡酮 + TX、丁酮威 + TX、丁酮虱威 + TX、丁基噻蟻酮 + TX、多硫化鈣 + TX、八氯蒽烯 + TX、氯滅殺威 + TX、三硫磷 + TX、蟻蟬胺 + TX、滅蟻猛 + TX、殺蟻醚 + TX、殺蟲脒 + TX、殺蟲脒鹽酸鹽 + TX、殺蟻醇 + TX、殺蟻酯 + TX、敵蟻特 + TX、乙酯殺蟻醇 + TX、滅蟻脒(chloromebuform) + TX、滅蟲脒 + TX、丙酯殺蟻醇 + TX、蟲蟻磷 + TX、瓜菊酯I + TX、瓜菊酯II + TX、瓜菊酯 + TX、克羅散泰 + TX、蠅毒磷 + TX、克羅米通 + TX、巴毒磷 + TX、硫雜靈 + TX、果蟲磷 + TX、DCPM + TX、DDT + TX、田樂磷 + TX、田樂磷-O + TX、田樂磷-S + TX、內吸磷-甲基 + TX、內吸磷-O + TX、內吸磷-O-甲基 + TX、內吸磷-S + TX、內吸磷-S-甲基 + TX、磺吸磷(demeton-S-methylsulfon) + TX、抑菌靈 + TX、敵敵畏 + TX、dicliphos + TX、除蟻靈 + TX、甲氟磷 + TX、消蟻酚(dinex) + TX、消蟻酚(dinex-

diclexine) + TX、敵蟎普-4 + TX、敵蟎普-6 + TX、鄰敵蟎消 + TX、硝戊酯 + TX、硝辛酯殺蟎劑 + TX、硝丁酯 + TX、敵殺磷 + TX、磺基二苯 + TX、戒酒硫 + TX、DNOC + TX、苯氧炔蟎 (dofenapyn) + TX、朵拉克汀 + TX、因毒磷 + TX、依立諾克丁 + TX、益硫磷 + TX、乙噻硫磷 + TX、抗蟎唑 + TX、苯丁錫 + TX、苯硫威 + TX、fenpyrad + TX、啞蟎酯 + TX、胺苯吡菌酮 + TX、除蟎酯 + TX、氟硝二苯胺 (fentrifanil) + TX、氟蟎噻 + TX、氟蟎脲 + TX、聯氟蟎 + TX、氟殺蟎 + TX、FMC 1137 + TX、伐蟲脘 + TX、伐蟲脘鹽酸鹽 + TX、胺甲威 (formparanate) + TX、 γ -HCH + TX、果綠定 + TX、苧蟎醚 + TX、十六烷基環丙烷羧酸酯 + TX、水胺硫磷 + TX、茉莉菊酯 I + TX、茉莉菊酯 II + TX、碘硫磷 + TX、林丹 + TX、丙蟎氰 + TX、滅蚜磷 + TX、二噻磷 + TX、甲硫芬 + TX、蟲蟎畏 + TX、溴甲烷 + TX、速滅威 + TX、自克威 + TX、米爾貝肱 + TX、丙胺氟 + TX、久效磷 + TX、茂果 + TX、莫昔克丁 + TX、二溴磷 (naled) + TX、4-氯-2-(2-氯-2-甲基-丙基)-5-[(6-碘-3-吡啶基)甲氧基]嗒吡-3-酮 + TX、氟蟎靈 + TX、尼可黴素 + TX、戊氰威 + TX、戊氰威1:1 氯化鋅錯合物 + TX、氧樂果 + TX、亞異砒磷 + TX、砒拌磷 + TX、pp'-DDT + TX、對硫磷 + TX、苧氯菊酯 + TX、芬硫磷 + TX、伏殺磷 + TX、硫環磷 + TX、磷胺 + TX、氯化松節油 (polychloroterpenes) + TX、殺蟎素 (polynactins) + TX、丙氯諾 + TX、蜚虱威 + TX、殘殺威 + TX、乙噻唑磷 + TX、發疏磷 + TX、除蟲菊酯I + TX、除蟲菊酯II + TX、除蟲菊酯 + TX、嗒吡硫磷 + TX、噻硫磷 + TX、喹硫磷 (quinalphos) + TX、喹硫磷 (quintiofos) + TX、R-1492 + TX、甘胺硫磷 + TX、魚藤酮 + TX、八甲磷 + TX、克線丹 + TX、司拉克丁 + TX、蘇硫磷 + TX、SSI-121 + TX、舒非侖 + TX、氟蟲胺 + TX、硫特普 + TX、硫 + TX、氟蟎吡 + TX、 τ -氟胺氰菊酯 + TX、TEPP + TX、叔丁威 + TX、四氯殺蟎砒 + TX、殺蟎好 + TX、thiafenox + TX、抗蟲威 + TX、久效威 + TX、甲

基乙拌磷 + TX、克殺蟎 + TX、蘇力菌素 + TX、威菌磷 + TX、苯蟎噻 + TX、
 三唑磷 + TX、滅蚜唑 (triazuron) + TX、三氯丙氧磷 + TX、三活菌素 + TX、
 蚜滅多 + TX、甲烯氟蟲腈 (vaniliprole) + TX、百殺辛 (bethoxazin) + TX、
 二辛酸銅 + TX、硫酸銅 + TX、cybutryne + TX、二氯萘醌 + TX、雙氯酚 +
 TX、菌多酸 + TX、三苯錫 + TX、熟石灰 + TX、代森鈉 + TX、滅藻醌 + TX、
 醌苳胺 + TX、西瑪津 + TX、三苯基乙酸錫 + TX、三苯基氫氧化錫 + TX、育
 畜磷 + TX、哌吡 + TX、托布津 + TX、氯醛糖 + TX、倍硫磷 + TX、吡啶-4-
 胺 + TX、士的寧 + TX、1-羥基-1H-吡啶-2-硫酮 + TX、4-(喹啉-2-基胺基)苯
 磺醯胺 + TX、8-羥基喹啉硫酸鹽 + TX、溴硝醇 + TX、氫氧化銅 + TX、甲酚
 + TX、雙吡硫翁 + TX、多地辛 + TX、敵磺鈉 + TX、甲醛 + TX、汞加芬 + TX、
 春雷黴素 + TX、春雷黴素鹽酸鹽水合物 + TX、二(二甲基二硫代胺基甲酸)鎳 +
 TX、三氯甲基吡啶 + TX、辛噻酮 + TX、奧索利酸 + TX、土黴素 + TX、羥基
 喹啉硫酸鉀 + TX、噻菌靈 + TX、鏈黴素 + TX、鏈黴素倍半硫酸鹽 + TX、葉
 枯猷 + TX、硫柳汞 + TX、棉褐帶卷蛾GV+ TX、放射形土壤桿菌 + TX、鈍綏
 蟎屬物種 (Amblyseius spp.) + TX、芹菜夜蛾NPV+ TX、原櫻翅繭小蜂 (Anagrus
 atomus) + TX、短距蚜小蜂 (Aphelinus abdominalis) + TX、棉蚜寄生蜂 (Aphidius
 colemani) + TX、食蚜瘿蚊 (Aphidoletes aphidimyza) + TX、苜蓿銀紋夜蛾NPV+
 TX、球形芽孢桿菌 (Bacillus sphaericus Neide) + TX、布氏白僵菌 (Beauveria
 brongniartii) + TX、普通草蛉 (Chrysoperla carnea) + TX、孟氏隱唇瓢蟲
 (Cryptolaemus montrouzieri) + TX、蘋果蠹蛾GV+ TX、西伯利亞離顎繭蜂
 (Dacnusa sibirica) + TX、豌豆潛葉蠅姬小蜂 (Diglyphus isaea) + TX、麗蚜小
 蜂 (Encarsia formosa) + TX、槲角蚜小蜂 (Eretmocerus eremicus) + TX、嗜菌異
 小桿線蟲 (Heterorhabditis bacteriophora) 和大異小桿線蟲 (H. megidis) + TX、
 斑長足瓢蟲 (Hippodamia convergens) + TX、橘粉介殼蟲寄生蜂 (Leptomastix

dactylopii) + TX、盲蝽 (*Macrolophus caliginosus*) + TX、甘藍夜蛾NPV+ TX、黃闊柄跳小蜂 (*Metaphycus helvolus*) + TX、黃綠綠僵菌 (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) + TX、金龜子綠僵菌小孢變種(*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) + TX、歐洲新松葉蜂 (*Neodiprion sertifer*) NPV和紅頭新松葉蜂 (*N. lecontei*) NPV + TX、小花蝽屬物種 + TX、玫煙色擬青黴 (*Paecilomyces fumosoroseus*) + TX、智利小植綫蟎 (*Phytoseiulus persimilis*) + TX、毛蚊綫蟲 (*Steinernema bibionis*) + TX、小卷蛾斯氏綫蟲 (*Steinernema carpocapsae*) + TX、夜蛾斯氏綫蟲 + TX、格氏綫蟲 (*Steinernema glaseri*) + TX、銳比斯氏綫蟲 (*Steinernema riobrave*) + TX、*Steinernema riobrave* + TX、螻蛄斯氏綫蟲(*Steinernema scapterisci*) + TX、斯氏綫蟲屬物種 (*Steinernema* spp.) + TX、赤眼蜂屬物種 + TX、西方盲走蟎 (*Typhlodromus occidentalis*) + TX、蠟蚧輪枝菌 (*Verticillium lecanii*) + TX、啞磷吡 (*apholate*) + TX、雙(氮丙啶)甲胺基磷硫化物 (*bisazir*) + TX、白消安 + TX、迪麥替夫 (*dimatif*) + TX、六甲蜜胺 (*hemeI*) + TX、六甲磷 (*hempa*) + TX、甲基涕巴 (*metepa*) + TX、甲硫涕巴 (*methiotepa*) + TX、甲基啞磷吡 (*methyl apholate*) + TX、不孕啶 (*morzid*) + TX、氟幼脲 (*penfluron*) + TX、涕巴 (*tepa*) + TX、硫代六甲磷 (*thiohempa*) + TX、硫涕巴+ TX、曲他胺 + TX、尿烷亞胺 + TX、(E)-癸-5-烯-1-基乙酸酯與(E)-癸-5-烯-1-醇 + TX、(E)-十三碳-4-烯-1-基乙酸酯 + TX、(E)-6-甲基庚-2-烯-4-醇 + TX、(E,Z)-十四碳-4,10-二烯-1-基乙酸酯 + TX、(Z)-十二碳-7-烯-1-基乙酸酯 + TX、(Z)-十六碳-11-烯醛 + TX、(Z)-十六碳-11-烯-1-基乙酸酯 + TX、(Z)-十六碳-13-烯-11-炔-1-基乙酸酯 + TX、(Z)-二十-13-烯-10-酮 + TX、(Z)-十四碳-7-烯-1-醛 + TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-醇 + TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-基乙酸酯 + TX、(7E,9Z)-十二碳-7,9-二烯-1-基乙酸酯 + TX、(9Z,11E)-十四碳-9,11-二烯-1-基乙酸酯 + TX、(9Z,12E)-十四碳-9,12-二烯-1-基乙酸酯 + TX、14-甲基十八碳-1-烯 + TX、4-甲基壬-5-醇與4-甲基壬-5-酮 + TX、

α -多紋素 + TX、西部松小蠹集合資訊素 + TX、十二碳二烯醇 (codlure) + TX、
 可得蒙 (codlemone) + TX、誘蠅酮 (cuelure) + TX、環氧十九烷 + TX、十二碳
 -8-烯-1-基乙酸酯 + TX、十二碳-9-烯-1-基乙酸酯 + TX、十二碳-8 + TX、10-二
 烯-1-基乙酸酯 + TX、dominicalure + TX、4-甲基辛酸乙酯 + TX、丁香酚 + TX、
 南部松小蠹集合資訊素 (frontalin) + TX、誘殺烯混劑 (grandlure) + TX、誘殺
 烯混劑I + TX、誘殺烯混劑II + TX、誘殺烯混劑III + TX、誘殺烯混劑IV + TX、
 己誘劑 (hexalure) + TX、齒小蠹二烯醇 (ipsdienol) + TX、小蠹烯醇 (ipsenol)
 + TX、金龜子性誘劑 (japonilure) + TX、三甲基二氧三環壬烷 (lineatin) + TX、
 litlure + TX、粉紋夜蛾性誘劑 (looplure) + TX、誘殺酯 (medlure) + TX、megatomoic
 acid + TX、誘蟲醚 (methyl eugenol) + TX、誘蟲烯 (muscalure) + TX、十八碳
 -2,13-二烯-1-基乙酸酯 + TX、十八碳-3,13-二烯-1-基乙酸酯 + TX、賀康彼
 (orfralure) + TX、椰蛀犀金龜聚集資訊素 (oryctalure) + TX、非樂康 (ostramone)
 + TX、誘蟲環 (siglure) + TX、sordidin + TX、食菌甲誘醇 (sulcatol) + TX、十
 四碳-11-烯-1-基乙酸酯 + TX、地中海實蠅引誘劑 (trimedlure) + TX、地中海
 實蠅引誘劑A + TX、地中海實蠅引誘劑B1 + TX、地中海實蠅引誘劑B2 + TX、
 地中海實蠅引誘劑C + TX、trunc-call + TX、2-(辛基硫代)乙醇 + TX、避蚊酮
 (butopyronoxyl) + TX、丁氧基(聚丙二醇) + TX、己二酸二丁酯 + TX、鄰苯二
 甲酸二丁酯 + TX、丁二酸二丁酯 + TX、避蚊胺 + TX、驅蚊酯 (dimethyl carbate)
 + TX、鄰苯二甲酸二甲酯 + TX、乙基己二醇 + TX、己脲 (hexamide) + TX、
 甲喹丁 (methoquin-butyl) + TX、甲基新癸醯胺 (methylneodecanamide) + TX、
 草醯胺酸酯 (oxamate) + TX、羥哌酯 (picaridin) + TX、1-二氯-1-硝基乙烷 +
 TX、1,1-二氯-2,2-二(4-乙基苯基)乙烷 + TX、1,2-二氯丙烷與1,3-二氯丙烯 + TX、
 1-溴-2-氯乙烷 + TX、2,2,2-三氯-1-(3,4-二氯苯基)乙基乙酸酯 + TX、2,2-二氯乙
 烯基 2-乙基亞磺醯基乙基甲基磷酸酯 + TX、2-(1,3-二硫戊環-2-基)苯基 二甲基

胺基甲酸酯 + TX、2-(2-丁氧基乙氧基)乙基硫氰酸酯 + TX、2-(4,5-二甲基-1,3-
 二氧戊環-2-基)苯基 甲基胺基甲酸酯 + TX、2-(4-氯-3,5-二甲苯基氧基)乙醇 +
 TX、2-氯乙基 二乙基磷酸酯 + TX、2-咪唑啉酮 + TX、2-異戊醯二氫茛-1,3-
 二酮 + TX、2-甲基(丙-2-炔基)胺基苯基 甲基胺基甲酸酯 + TX、2-氰硫基乙基
 月桂酸酯 + TX、3-溴-1-氯丙-1-烯 + TX、3-甲基-1-苯基吡唑-5-基 二甲基胺基
 甲酸酯 + TX、4-甲基(丙-2-炔基)胺基-3,5-二甲苯基 甲基胺基甲酸酯 + TX、5,5-
 二甲基-3-側氧基環己-1-烯基 二甲基胺基甲酸酯 + TX、阿賽硫磷 + TX、丙烯
 腈 + TX、艾氏劑 + TX、阿洛胺菌素 + TX、除害威 + TX、 α -蛻化素 + TX、磷
 化鋁 + TX、滅害威 + TX、新菸鹼 + TX、乙基殺撲磷 (athidathion) + TX、甲
 基吡啶磷 + TX、蘇雲金芽孢桿菌 δ -內毒素 + TX、六氟矽酸鋇 + TX、多硫化鋇
 + TX、熏菊酯 + TX、拜耳22/190 + TX、拜耳22408 + TX、 β -氟氯氰菊酯 + TX、
 β -氯氰菊酯 + TX、戊環苄呋菊酯 (bioethanomethrin) + TX、生物氯菊酯 + TX、
 雙(2-氯乙基)醚 + TX、硼砂 + TX、溴苯烯磷 + TX、溴-DDT + TX、合殺威 + TX、
 畜蟲威 + TX、特嘑硫磷 (butathiofos) + TX、丁酯磷 + TX、砷酸鈣 + TX、氰
 化鈣 + TX、二硫化碳 + TX、四氯化碳 + TX、巴丹鹽酸鹽 + TX、瑟瓦定 (cevadine)
 + TX、冰片丹 + TX、氯丹 + TX、十氯酮 + TX、氯仿 + TX、氯化苦 + TX、
 氯膦肟磷 + TX、氯吡唑磷 (chlorprazophos) + TX、順式苄呋菊酯 (cis-resmethrin)
 + TX、順式苄呋菊酯 (cismethrin) + TX、氯菊酯 (clocythrins) (別名) + TX、
 乙醯亞砷酸銅 + TX、砷酸銅 + TX、油酸銅 + TX、畜蟲磷 (coumithoate) + TX、
 冰晶石 + TX、CS 708 + TX、苯腈磷 + TX、殺螟腈 + TX、環蟲菊 + TX、賽滅
 磷 + TX、d-胺菊酯 + TX、DAEP + TX、棉隆 + TX、脫甲基克百威 (decarbofuran)
 + TX、除線特 (diamidafos) + TX、異氯磷 + TX、除線磷 + TX、dicresyl + TX、
 環蟲腈 + TX、狄氏劑 + TX、二乙基5-甲基吡唑-3-基磷酸酯 + TX、喘定 (dior)
 + TX、四氟甲醚菊酯 + TX、地麥威 + TX、苄菊酯 + TX、甲基毒蟲畏 + TX、

敵蠅威 + TX、丙硝酚 + TX、戊硝酚 + TX、地樂酚 + TX、苯蟲醚 + TX、蔬果磷 + TX、噻喃磷 + TX、DSP + TX、脫皮甾酮 + TX、EI 1642 + TX、EMPC + TX、EPBP + TX、etaphos + TX、乙硫苯威 + TX、甲酸乙酯 + TX、二溴乙烷 + TX、二氯乙烷 + TX、環氧乙烷 + TX、EXD + TX、皮蠅磷 + TX、乙苯威 + TX、殺螟硫磷 + TX、氧嘧醯胺 (fenoxacrim) + TX、吡氯氰菊酯 + TX、豐索磷 + TX、乙基倍硫磷 + TX、氟氯雙苯隆 (flucofuron) + TX、丁苯硫磷 + TX、磷砒酯 + TX、丁環硫磷 + TX、呋線威 + TX、抗蟲菊 + TX、雙胍辛鹽 + TX、雙胍辛乙酸鹽 + TX、四硫代碳酸鈉 + TX、苜蓿醚 (halfenprox) + TX、HCH + TX、HEOD + TX、七氯 + TX、速殺硫磷 + TX、HHDN + TX、氰化氫 + TX、啞啞威 + TX、IPSP + TX、氯唑磷 + TX、碳氯靈 + TX、異艾氏劑 + TX、異柳磷 + TX、移栽靈 + TX、稻瘟靈 + TX、惡唑磷 + TX、保幼激素I + TX、保幼激素II + TX、保幼激素III + TX、氯戊環 + TX、烯蟲炔酯 + TX、砷酸鉛 + TX、溴苯磷 + TX、啞蟲磷 + TX、噻唑磷 + TX、間異丙苯基甲基胺基甲酸酯 + TX、磷化鎂 + TX、疊氮磷 + TX、甲基滅蚜磷 + TX、滅蚜硫磷 + TX、氯化亞汞 + TX、甲亞砷磷 + TX、威百畝 + TX、威百畝鉀鹽 + TX、威百畝鈉鹽 + TX、甲基磺醯氟 + TX、丁烯胺磷 + TX、甲氧普林 + TX、甲醚菊酯 + TX、甲氧滴滴涕 + TX、異硫氰酸甲酯 + TX、甲基氯仿 + TX、二氯甲烷 + TX、惡蟲酮 + TX、滅蟻靈 + TX、奈肽磷 + TX、萘 + TX、NC-170 + TX、菸鹼 + TX、硫酸菸鹼 + TX、硝蟲噻吡 + TX、原菸鹼 + TX、O-5-二氯-4-碘代苯基 O-乙基乙基硫代磷酸酯 + TX、O,O-二乙基 O-4-甲基-2-側氧基-2H-苯并吡喃-7-基硫代磷酸酯 + TX、O,O-二乙基 O-6-甲基-2-丙基嘧啶-4-基硫代磷酸酯 + TX、O,O,O',O'-四丙基二硫代焦磷酸酯 + TX、油酸 + TX、對-二氯苯 + TX、甲基對硫磷 + TX、五氯苯酚 + TX、月桂酸五氯苯酯 + TX、PH 60-38 + TX、芬硫磷 + TX、對氯硫磷 + TX、磷化氫 + TX、甲基辛硫磷 + TX、甲胺嘧磷 + TX、多氯二環戊二烯異構

物 + TX、亞砷酸鉀 + TX、硫氰酸鉀 + TX、早熟素I + TX、早熟素II + TX、早熟素III + TX、醯胺嘧啶磷 + TX、丙氟菊酯 + TX、猛殺威 + TX、丙硫磷 + TX、吡菌磷 + TX、反滅蟲菊 + TX、苦木萃取物 (quassia) + TX、噠硫磷-甲基 + TX、畜寧磷 + TX、碘柳胺 + TX、苜呋菊脂 + TX、魚藤酮 + TX、噠噠菊酯 + TX、魚尼汀 + TX、利阿諾定 + TX、沙巴藜蘆 (sabadilla) + TX、八甲磷 + TX、克線丹 + TX、SI-0009 + TX、噠丙腈 + TX、亞砷酸鈉 + TX、氰化鈉 + TX、氟化鈉 + TX、六氟矽酸鈉 + TX、五氯苯酚鈉 + TX、硒酸鈉 + TX、硫氰酸鈉 + TX、磺苯醌隆 (sulcofuron) + TX、磺苯醌隆鈉鹽 (sulcofuron-sodium) + TX、硫醯氟 + TX、硫丙磷 + TX、焦油 + TX、噠蟎威 + TX、TDE + TX、丁基嘧啶磷 + TX、雙硫磷 + TX、環戊烯丙菊酯 + TX、四氯乙烷 + TX、噠氯磷 + TX、殺蟲環 + TX、殺蟲環草酸鹽 + TX、蟲線磷 + TX、殺蟲單 + TX、殺蟲單鈉 + TX、四溴菊酯 + TX、反氯菊酯 + TX、啞蚜威 + TX、異皮蠅磷-3 (trichlormetaphos-3) + TX、毒壤磷 + TX、混殺威 + TX、三氟甲氧威 (tolprocarb) + TX、氯啞菌酯 + TX、烯蟲硫酯 + TX、藜蘆定 + TX、藜蘆鹼 + TX、XMC + TX、zetamethrin + TX、磷化鋅 + TX、啞蟲磷 + TX、以及氯氟醚菊酯 + TX、四氟醚菊酯 + TX、雙(三丁基錫)氧化物 + TX、溴乙醯胺 + TX、磷酸鐵 + TX、氯硝柳胺-乙醇胺 + TX、三丁基氧化錫 + TX、吡味啉 + TX、蝸螺殺 + TX、1,2-二溴-3-氯丙烷 + TX、1,3-二氯丙烯 + TX、3,4-二氯四氫噻吩 1,1-二氧化物 + TX、3-(4-氯苯基)-5-甲基玫瑰寧 + TX、5-甲基-6-硫代-1,3,5-噠二吡-3-基乙酸 + TX、6-異戊烯基胺基嘧啶 + TX、2-氟-N-(3-甲氧基苯基)-9H-嘧啶-6-胺 + TX、苯氯噠 (benclotiaz) + TX、細胞分裂素 + TX、DCIP + TX、糠醛 + TX、異醯胺磷 (isamidofos) + TX、激動素 + TX、疣孢漆斑菌組成物 + TX、四氯噠吩 + TX、二甲苯酚 + TX、玉米素 + TX、乙基黃原酸鉀 + TX、阿拉酸式苯 + TX、阿拉酸式苯-S-甲基 + TX、大虎杖 (Reynoutria sachalinensis) 萃取物 + TX、 α -氯代醇 + TX、安妥 +

TX、碳酸鋇 + TX、雙鼠脲 + TX、溴鼠隆 + TX、溴敵隆（包括 α -溴敵隆） + TX、溴鼠胺 + TX、氯鼠酮 + TX、膽鈣化醇 + TX、氯殺鼠靈 + TX、克滅鼠 + TX、殺鼠萘 + TX、殺鼠嘧啶 + TX、鼠得克 + TX、噻鼠靈 + TX、敵鼠 + TX、鈣化醇 + TX、氟鼠靈 + TX、氟乙醯胺 + TX、氟鼠啶 + TX、氟鼠啶鹽酸鹽 + TX、鼠特靈 + TX、毒鼠磷 + TX、磷 + TX、殺鼠酮 + TX、滅鼠優 + TX、海蔥糖苷 + TX、氟乙酸鈉 + TX、硫酸鉍 + TX、殺鼠靈 + TX、2-(2-丁氧基乙氧基)乙基胡椒酸酯 + TX、5-(1,3-苯并二氧雜環戊烯-5-基)-3-己基環己-2-烯酮 + TX、具有橙花三級醇的茵綠烯醇 + TX、增效炔醚 + TX、MGK 264 + TX，增效醚 + TX、增效醛 + TX、增效酯（propyl isomer） + TX、S421 + TX、增效散 + TX、芝麻林素（sesasmolin） + TX、亞砒 + TX、蔥醌 + TX、環烷酸銅 + TX、王銅 + TX、二環戊二烯 + TX、塞侖 + TX、環烷酸鋅 + TX、福美鋅 + TX、衣馬寧 + TX、利巴韋林 + TX、氯吡啶醯肼（chloroinconazide） + TX、氧化汞 + TX、甲基托布津 + TX、阿紮康唑 + TX、聯苯三唑醇 + TX、糠菌唑 + TX、環唑醇 + TX、苯醚甲環唑 + TX、烯唑醇 + TX、氟環唑 + TX、腈苯唑 + TX、氟喹唑 + TX、氟矽唑 + TX、粉唑醇 + TX、呋吡菌胺 + TX、己唑醇 + TX、抑黴唑 + TX、亞胺唑 + TX、種菌唑 + TX、葉菌唑 + TX、腈菌唑 + TX、多效唑 + TX、稻瘟酯 + TX、戊菌唑 + TX、丙硫菌唑 + TX、啞斑脞（pyrifenoxy） + TX、咪鮮胺 + TX、丙環唑 + TX、啞菌唑 + TX、矽氟唑（simeconazole） + TX、戊唑醇 + TX、氟醚唑 + TX、三唑酮 + TX、三唑醇 + TX、氟菌唑 + TX、滅菌唑 + TX、嘧啶醇 + TX、氯苯嘧啶醇 + TX、氟苯嘧啶醇 + TX、乙嘧啶磺酸酯（bupirimate） + TX、甲菌定（dimethirimol） + TX、乙菌定（ethirimol） + TX、十二環咪啉 + TX、苯鏽啶（fenpropidin） + TX、丁苯咪啉 + TX、螺環菌胺 + TX、十三咪啉 + TX、嘧菌環胺 + TX、嘧菌胺 + TX、嘧黴胺（pyrimethanil） + TX；拌種咯 + TX、咯菌腈 + TX、苯霜靈（benalaxyl） + TX、呋霜靈（furalaxyl）

+ TX、甲霜靈 + TX、R-甲霜靈 + TX；呋醯胺 + TX；惡霜靈 (oxadixyl) + TX、多菌靈 + TX、咪菌威 (debacarb) + TX、麥穗寧 + TX、噻苯達唑 + TX、乙菌利 (chlozolate) + TX、菌核利 (dichlozoline) + TX、甲菌利 (myclozoline) + TX、腐黴利 (procymidone) + TX、乙烯菌核利 (vinclozoline) + TX、啞醯菌胺 (boscalid) + TX、菱鏽靈 + TX、甲呋醯胺 + TX、氟醯胺 (flutolanil) + TX、滅鏽胺 + TX、氧化菱鏽靈 + TX、吡噻菌胺 (penthiopyrad) + TX、噻呋醯胺 + TX、多果定 + TX、雙胍辛胺 + TX、嘧菌酯 + TX、醚菌胺 + TX、烯肟菌酯 (enestroburin) + TX、烯肟菌胺 + TX、氟菌蟎酯 + TX、氟嘧菌酯 + TX、醚菌酯 + TX、苯氧菌胺 + TX、肟菌酯 + TX、肟醚菌胺 + TX、啞氧菌酯 + TX、啞菌胺酯 + TX、啞胺菌酯 + TX、啞菌酯 + TX、福美鐵 + TX、代森錳鋅 + TX、代森錳 + TX、代森聯 + TX、甲基代森鋅 + TX、代森鋅 + TX、敵菌丹 + TX、克菌丹 + TX、啞味草 + TX、滅菌丹 + TX、對甲抑菌靈 + TX、波爾多混合劑 + TX、氧化銅 + TX、代森錳銅 + TX、啞啞銅 + TX、酞菌酯 + TX、克瘟散 + TX、異稻瘟淨 + TX、氣瘟磷 + TX、甲基立枯磷 + TX、敵菌靈 + TX、苯噻菌胺 + TX、滅瘟素 (blasticidin) + TX、地茂散 (chloroneb) + TX、百菌清 + TX、環氟菌胺 + TX、霜脞氰 + TX、cyclobutrifluram + TX、雙氯氰菌胺 (diclocymet) + TX、噻菌酮 (diclomezine) + TX、氯硝胺 (dicloran) + TX、乙黴威 (diethofencarb) + TX、烯醯味啉 + TX、氟味啉 + TX、二噻農 (dithianon) + TX、噻啞菌胺 (ethaboxam) + TX、土菌靈 (etridiazole) + TX、惡啞菌酮 + TX、咪啞菌酮 (fenamidone) + TX、稻瘟醯胺 (fenoxanil) + TX、嘧菌腴 (ferimzone) + TX、氟啞胺 (fluazinam) + TX、氟吡菌胺 (fluopicolide) + TX、磺菌胺 (flusulfamide) + TX、氟啞菌醯胺 + TX、環醯菌胺 + TX、三乙膦酸鋁 (fosetyl-aluminium) + TX、惡黴靈 (hymexazol) + TX、丙森鋅 + TX、賽座滅 (cyazofamid) + TX、磺菌威 (methasulfocarb) + TX、苯菌酮 + TX、戊菌隆 (pencycuron) + TX、苯酞 + TX、

多氧黴素 (polyoxins) + TX、霜黴威 (propamocarb) + TX、吡菌苯威 + TX、碘喹啉酮 (proquinazid) + TX、咯喹酮 (pyroquilon) + TX、苯啉菌酮 (pyriofenone) + TX、喹氧靈 + TX、五氯硝基苯 + TX、噻醯菌胺 + TX、咪唑吡啉 (triazoxide) + TX、三環唑 + TX、吡啶靈 + TX、有效黴素 + TX、纈菌胺 + TX、苯醯菌胺 (zoxamide) + TX、雙炔醯菌胺 (mandipropamid) + TX、氟苯醚醯菌胺 (flubeneteram) + TX、吡啶菌胺 (isopyrazam) + TX、氟唑環菌胺 (sedaxane) + TX、苯并烯氟菌唑 + TX、氟唑菌醯脲胺 + TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酸(3',4',5'-三氟-聯苯-2-基)-醯胺 + TX、isoflucypram + TX、異噻菌胺 + TX、dipymetitrone + TX、6-乙基-5,7-二側氧基-吡咯并[4,5][1,4]二硫雜[1,2-c]異噻唑-3-甲脞 + TX、2-(二氟甲基)-N-[3-乙基-1,1-二甲基-二氫茛-4-基]吡啶-3-甲醯胺 + TX、4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基-5-苯基-噁吡啶-3-甲脞 + TX、(R)-3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[1,1,3-三甲基二氫茛-4-基]吡啶-4-甲醯胺 + TX、4-(2-溴-4-氟-苯基)-N-(2-氯-6-氟-苯基)-2,5-二甲基-吡啶-3-胺 + TX、4-(2-溴-4-氟-苯基)-N-(2-氯-6-氟-苯基)-1,3-二甲基-1H-吡啶-5-胺 + TX、fluindapyr + TX、甲香菌酯 (jiaxiangjunzhi) + TX、lvbenmixianan + TX、dichlobentiazox + TX、曼德斯賓 (mandestrobin) + TX、3-(4,4-二氟-3,4-二氫-3,3-二甲基異噻啉-1-基)噻啉酮 + TX、2-[2-氟-6-[(8-氟-2-甲基-3-噻啉基)氧基]苯基]丙-2-醇 + TX、噻啉菌靈 (oxathiapiprolin) + TX、N-[6-[[[(1-甲基四唑-5-基)-苯基-亞甲基]胺基]氧基甲基]-2-吡啶基]胺基甲酸三級丁酯 + TX、pyraziflumid + TX、inpyrfluxam + TX、trolprocarb + TX、氯氟醚菌唑 + TX、ipfentrifluconazole + TX、2-(二氟甲基)-N-[(3R)-3-乙基-1,1-二甲基-二氫茛-4-基]吡啶-3-甲醯胺 + TX、N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脞 + TX、N'-[4-(4,5-二氯噻唑-2-基)氧基-2,5-二甲基-苯基]-N-乙基-N-甲基-甲脞 + TX、[2-[3-[2-[1-[2-[3,5-雙(二氟甲基)吡啶-1-基]乙醯基]-4-吡啶基]噻唑-4-基]-4,5-二氫異噻唑-5-基]-3-氯-苯基] 甲磺酸鹽 + TX、N-[6-[(Z)-[(1-甲基四唑-5-基)-苯基-亞甲

基]胺基]氧基甲基]-2-吡啶基]胺基甲酸丁-3-炔酯 + TX、N-[[5-[4-(2,4-二甲基苯基)三唑-2-基]-2-甲基-苯基]胺基]胺基甲酸甲酯 + TX、3-氯-6-甲基-5-苯基-4-(2,4,6-三氟苯基)嗒吡 + TX、pyridachlometyl + TX、3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[1,1,3-三甲基二氫茛-4-基]吡啶-4-甲醯胺 + TX、1-[2-[[1-(4-氯苯基)吡啶-3-基]氧基甲基]-3-甲基-苯基]-4-甲基-四唑-5-酮 + TX、1-甲基-4-[3-甲基-2-[[2-甲基-4-(3,4,5-三甲基吡啶-1-基)苯氧基]甲基]苯基]四唑-5-酮 + TX、aminopyrifen + TX、啞嘧菌胺 + TX、吡啶菌胺 + TX、氟啞菌胺 + TX、(Z,2E)-5-[1-(4-氯苯基)吡啶-3-基]氧基-2-甲氧基亞胺基-N,3-二甲基-戊-3-烯胺 + TX、florylpicoxamid + TX、苯吡克咪德 (fenpicoxamid) + TX、異丁乙氧喹啉 + TX、ipflufenquin + TX、quinofumelin + TX、異丙噻菌胺 + TX、N-[2-[2,4-二氯-苯氧基]苯基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-吡啶-4-甲醯胺 + TX、N-[2-[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]苯基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-吡啶-4-甲醯胺 + TX、苯噻菌酯 + TX、氟烯菌酯 + TX、5-胺基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇鋅鹽(2:1) + TX、氟吡菌醯胺 + TX、氟噻啞菌脒 + TX、氟醚菌醯胺 + TX、pyrapropoyne + TX、哌啶啞 (picarbutrazox) + TX、2-(二氟甲基)-N-(3-乙基-1,1-二甲基-二氫茛-4-基)吡啶-3-甲醯胺 + TX、2-(二氟甲基)-N-((3R)-1,1,3-三甲基二氫茛-4-基)吡啶-3-甲醯胺 + TX、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羥基-3-(1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲脒 + TX、metyltetraprole + TX、2-(二氟甲基)-N-((3R)-1,1,3-三甲基二氫茛-4-基)吡啶-3-甲醯胺 + TX、 α -(1,1-二甲基乙基)- α -[4'-(三氟甲氧基)[1,1'-二苯基]-4-基]-5-嘧啶甲醇 + TX、fluoxapiprolin + TX、烯肱菌酯 (enoxastrobin) + TX、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羥基-3-(1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲脒 + TX、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羥基-3-(5-氫硫基-1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲脒 + TX、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羥基-3-(5-硫代-4H-1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲脒 + TX、抗倒酯 + TX、丁香菌酯 + TX、

中生菌素 + TX、噻菌銅 + TX、噻唑鋅 + TX、amectotractin + TX、異菌脲 + TX、N-辛基-N'-[2-(辛基胺基)乙基]乙烷-1,2-二胺 + TX；N'-[5-溴-2-甲基-6-[(1S)-1-甲基-2-丙氧基-乙氧基]-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒 + TX、N'-[5-溴-2-甲基-6-[(1R)-1-甲基-2-丙氧基-乙氧基]-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒 + TX、N'-[5-溴-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒 + TX、N'-[5-氯-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒 + TX、N'-[5-溴-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-異丙基-N-甲基-甲脒 + TX (該等化合物可以由WO 2015/155075中描述之方法製備)；N'-[5-溴-2-甲基-6-(2-丙氧基丙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒 + TX (這種化合物可以由IPCOM000249876D中描述之方法製備)；N-異丙基-N'-[5-甲氧基-2-甲基-4-(2,2,2-三氟-1-羥基-1-苯基-乙基)苯基]-N-甲基-甲脒+ TX、N'-[4-(1-環丙基-2,2,2-三氟-1-羥基-乙基)-5-甲氧基-2-甲基-苯基]-N-異丙基-N-甲基-甲脒 + TX (該等化合物可以由WO 2018/228896中描述之方法製備)；N-乙基-N'-[5-甲氧基-2-甲基-4-[(2-三氟甲基)氧雜環丁-2-基]苯基]-N-甲基-甲脒 + TX、N-乙基-N'-[5-甲氧基-2-甲基-4-[(2-三氟甲基)四氫呋喃-2-基]苯基]-N-甲基-甲脒 + TX (該等化合物可以由WO 2019/110427中描述之方法製備)；N-[(1R)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX、N-[(1S)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX、N-[(1R)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX、N-[(1S)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX、N-[(1R)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX、N-[(1S)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX、8-氟-N-[(1R)-1-[(3-氟苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]喹啉-3-甲醯胺 + TX、8-氟-N-[(1S)-1-[(3-氟苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]喹啉-3-甲醯胺 + TX、N-[(1R)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX、N-[(1S)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX、N-((1R)-1-苄基-3-氯

-1-甲基-丁-3-烯基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX、N-((1S)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX (該等化合物可以由WO 2017/153380中描述之方法製備)；1-(6,7-二甲基吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4,5-三氟-3,3-二甲基-異喹啉 + TX、1-(6,7-二甲基吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4,6-三氟-3,3-二甲基-異喹啉 + TX、4,4-二氟-3,3-二甲基-1-(6-甲基吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)異喹啉 + TX、4,4-二氟-3,3-二甲基-1-(7-甲基吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)異喹啉 + TX、1-(6-氯-7-甲基-吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-異喹啉 + TX (該等化合物可以由WO 2017/025510中描述之方法製備)；1-(4,5-二甲基苯并咪唑-1-基)-4,4,5-三氟-3,3-二甲基-異喹啉 + TX、1-(4,5-二甲基苯并咪唑-1-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-異喹啉 + TX、6-氯-4,4-二氟-3,3-二甲基-1-(4-甲基苯并咪唑-1-基)異喹啉 + TX、4,4-二氟-1-(5-氟-4-甲基-苯并咪唑-1-基)-3,3-二甲基-異喹啉 + TX、3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-1-異喹啉基)-7,8-二氫-6H-環戊并[e]苯并咪唑 + TX (該等化合物可以由WO 2016/156085中描述之方法製備)；N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]環丙烷甲醯胺 + TX、N,2-二甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙醯胺 + TX、N-乙基-2-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙醯胺 + TX、1-甲氧基-3-甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脲 + TX、1,3-二甲氧基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脲 + TX、3-乙基-1-甲氧基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脲 + TX、N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙醯胺 + TX、4,4-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]異噁唑啉-3-酮 + TX、5,5-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]異噁唑啉-3-酮 + TX、1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡啶-4-甲酸乙酯 + TX、N,N-二甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]-1,2,4-三唑-3-胺 + TX。此段落中的化合物可以由WO 2017/055473、WO 2017/055469、WO

2017/093348和WO 2017/118689中描述之方法製備；2-[6-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇 + TX（這種化合物可以由WO 2017/029179中描述之方法製備）；2-[6-(4-溴苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇 + TX（這種化合物可以由WO 2017/029179中描述之方法製備）；3-[2-(1-氯環丙基)-3-(2-氟苯基)-2-羥基-丙基]咪唑-4-甲腈 + TX（這種化合物可以由WO 2016/156290中描述之方法製備）；3-[2-(1-氯環丙基)-3-(3-氯-2-氟-苯基)-2-羥基-丙基]咪唑-4-甲腈 + TX（這種化合物可以由WO 2016/156290中描述之方法製備）；2-胺基-6-甲基-吡啶-3-甲酸(4-苯氧基苯基)甲酯 + TX（這種化合物可以由WO 2014/006945中描述之方法製備）；2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二硫雜[2,3-c:5,6-c']聯吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮 + TX（這種化合物可以由WO 2011/138281中描述之方法製備）；N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]硫代苯甲醯胺 + TX；N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醯胺 + TX；(Z,2E)-5-[1-(2,4-二氯苯基)吡啶-3-基]氧基-2-甲氧基亞胺基-N,3-二甲基-戊-3-烯胺 + TX（這種化合物可以由WO 2018/153707中描述之方法製備）；N'-(2-氯-5-甲基-4-苯氧基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒 + TX；N'-[2-氯-4-(2-氟苯氧基)-5-甲基-苯基]-N-乙基-N-甲基-甲脒 + TX（這種化合物可以由WO 2016/202742中描述之方法製備）；2-(二氟甲基)-N-[(3S)-3-乙基-1,1-二甲基-二氫茚-4-基]吡啶-3-甲醯胺 + TX（這種化合物可以由WO 2014/095675中描述之方法製備）；(5-甲基-2-吡啶基)-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲酮 + TX、(3-甲基異噁唑-5-基)-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲酮 + TX（該等化合物可以由WO 2017/220485中描述之方法製備）；2-側氧基-N-丙基-2-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙醯胺 + TX（這種化合物可以由WO 2018/065414中描述之方法製備）；1-[[5-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]-2-噻吩基]甲基]吡啶-4-甲酸乙酯 + TX（這種化合物可以由WO 2018/158365中描述之方法製備）；2,2-二氟-N-甲基-

2-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙醯胺 + TX、N-[(E)-甲氧基亞胺基甲基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醯胺 + TX、N-[(Z)-甲氧基亞胺基甲基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醯胺 + TX、N-[N-甲氧基-C-甲基-碳亞胺基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醯胺 + TX (該等化合物可以由WO 2018/202428中描述之方法製備)；

【0518】 微生物劑，包括：魯氏不動桿菌+ TX、枝頂孢屬真菌+ TX + TX、頂頭孢黴菌+ TX + TX、*Acremonium diospyri*+ TX、*Acremonium obclavatum* + TX、棉褐帶卷蛾顆粒體病毒 (AdoxGV) (Capex®) + TX、放射形土壤桿菌菌株K84 (Galltrol-A®) + TX、鏈格孢菌+ TX、決明鏈格孢 + TX、損毀鏈格孢 (*Alternaria destruens*) (Smolder®) + TX、白粉寄生孢 (AQ10®) + TX、黃麴菌AF36 (AF36®) + TX、黃麴菌NRRL 21882 (Aflaguard®) + TX、麴黴屬物種+ TX、出芽短梗黴菌+ TX、固氮螺菌+ TX、(MicroAZ® + TX、TAZO B®) + TX、固氮菌+ TX、褐球固氮菌 (*Azotobacter chroococcum*) (Azotomeal®) + TX、固氮菌囊孢 (Bionatural Blooming Blossoms®) + TX、解澱粉芽孢桿菌+ TX、蠟樣芽孢桿菌+ TX、蝕幾丁質芽孢桿菌菌株 (*Bacillus chitinosporus* strain) CM-1 + TX、蝕幾丁質芽孢桿菌菌株 (*Bacillus chitinosporus* strain) AQ746 + TX、地衣芽孢桿菌菌株HB-2 (Biostart™ Rhizoboost®) + TX、地衣芽孢桿菌菌株3086 (EcoGuard® + TX、Green Releaf®) + TX、環狀芽孢桿菌+ TX、堅強芽孢桿菌 (BioSafe®+ TX、BioNem-WP®+ TX、VOTiVO®) + TX、堅強芽孢桿菌菌株I-1582 + TX、浸麻芽孢桿菌+ TX、死海芽孢桿菌 (*Bacillus marismortui*) + TX、巨大芽孢桿菌+ TX、蕈狀芽孢桿菌菌株AQ726 + TX、乳突芽孢桿菌 (Milky Spore Powder®) + TX、短小芽孢桿菌屬物種+ TX、短小芽孢桿菌菌株GB34 (Yield Shield®) + TX、短小芽孢桿菌菌株AQ717 + TX、短小芽孢桿菌菌株QST 2808 (Sonata® + TX、Ballad Plus®) + TX、球形芽孢桿菌 (*Bacillus spahericus*) (VectoLex®) + TX、

芽孢桿菌屬物種+ TX、芽孢桿菌屬菌株AQ175 + TX、芽孢桿菌屬菌株AQ177 + TX、芽孢桿菌屬菌株AQ178 + TX、枯草芽孢桿菌菌株QST 713 (CEASE® + TX、Serenade® + TX、Rhapsody®) + TX、枯草芽孢桿菌菌株QST 714 (JAZZ®) + TX、枯草芽孢桿菌菌株AQ153 + TX、枯草芽孢桿菌菌株AQ743 + TX、枯草芽孢桿菌菌株QST3002 + TX、枯草芽孢桿菌菌株QST3004 + TX、解澱粉枯草芽孢桿菌變種菌株FZB24 (Taegro® + TX、Rhizopro®) + TX、蘇雲金芽孢桿菌Cry 2Ae + TX、蘇雲金芽孢桿菌Cry1Ab + TX、蘇雲金芽孢桿菌鯨澤 (*Bacillus thuringiensis aizawai*) GC 91 (Agree®) + TX、蘇雲金芽孢桿菌以色列 (*Bacillus thuringiensis israelensis*) (BMP123® + TX、Aquabac® + TX、VectoBac®) + TX、蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克 (*Bacillus thuringiensis kurstaki*) (Javelin® + TX、Deliver® + TX、CryMax® + TX、Bonide® + TX、Scutella WP® + TX、Turilav WP® + TX、Astuto® + TX、Dipel WP® + TX、Biobit® + TX、Foray®) + TX、蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克 BMP 123 (Baritone®) + TX、蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克 HD-1 (Bioprotec-CAF/3P®) + TX、蘇雲金芽孢桿菌菌株BD#32 + TX、蘇雲金芽孢桿菌菌株AQ52 + TX、蘇雲金芽孢桿菌鯨澤變種 (*Bacillus thuringiensis* var. *aizawai*) (XenTari® + TX、DiPel®) + TX、細菌屬物種 (*bacteria* spp.) (GROWMEND® + TX、GROWSWEET® + TX、Shootup®) + TX、*Clavipacter michiganensis* 噬菌體 (AgriPhage®) + TX、Bakflor® + TX、球孢白僵菌 (*Beauveria bassiana*) (Beaugenic® + TX、Brocaril WP®) + TX、球孢白僵菌GHA (Mycotrol ES® + TX、Mycotrol O® + TX、BotaniGuard®) + TX、布氏白僵菌 (*Beauveria brongniartii*) (Engerlingspilz® + TX、Schweizer Beauveria® + TX、Melocont®) + TX、白僵菌屬物種 (*Beauveria* spp.) + TX、灰葡萄孢菌 (*Botrytis cineria*) + TX、大豆慢生型根瘤菌 (*Bradyrhizobium japonicum*) (TerraMax®) + TX、短短小芽孢桿菌 (*Brevibacillus brevis*) + TX、蘇雲金芽孢桿菌擬步行甲 (*Bacillus thuringiensis*

tenebrionis)(Novodor®)+TX、BtBooster+TX、洋蔥伯克霍爾德菌(*Burkholderia cepacia*)(Deny®+TX、Intercept®+TX、Blue Circle®)+TX、伯克霍爾德菌(*Burkholderia gladii*)+TX、唐菖蒲伯克霍爾德菌(*Burkholderia gladioli*)+TX、伯克霍爾德菌屬物種(*Burkholderia spp.*)+TX、加拿大薊真菌(Canadian thistle fungus)(CBH Canadian Bioherbicide®)+TX、乳酪假絲酵母(*Candida butyri*)+TX、無名假絲酵母(*Candida famata*)+TX、*Candida fructus*+TX、光滑念珠菌(*Candida glabrata*)+TX、吉利蒙念珠菌(*Candida guilliermondii*)+TX、□津假絲酵母(*Candida melibiosica*)+TX、橄欖假絲酵母(*Candida oleophila*)菌株O+TX、近平滑假絲酵母(*Candida parapsilosis*)+TX、菌膜假絲酵母(*Candida pelliculosa*)+TX、鐵紅假絲酵母(*Candida pulcherrima*)+TX、瑞氏假絲酵母(*Candida reukaufii*)+TX、齊藤假絲酵母(*Candida saitoana*)(Bio-Coat®+TX、Biocure®)+TX、清酒假絲酵母(*Candida sake*)+TX、假絲酵母屬物種(*Candida spp.*)+TX、纖細假絲酵母(*Candida tenuis*)+TX、戴氏西地西菌(*Cedecea dravisae*)+TX、產黃纖維單胞菌(*Cellulomonas flavigena*)+TX、螺卷毛殼(*Chaetomium cochliodes*)(Nova-Cide®)+TX、球毛殼菌(*Chaetomium globosum*)(Nova-Cide®)+TX、鐵杉紫色桿菌(*Chromobacterium subtsugae*)菌株PRAA4-1T(Grandevo®)+TX、枝狀枝孢菌(*Cladosporium cladosporioides*)+TX、尖孢枝孢(*Cladosporium oxysporum*)+TX、綠頭枝孢(*Cladosporium chlorocephalum*)+TX、枝孢屬物種(*Cladosporium spp.*)+TX、極細枝孢黴(*Cladosporium tenuissimum*)+TX、粉紅黏帚黴(*Clonostachys rosea*)(EndoFine®)+TX、尖孢炭疽菌(*Colletotrichum acutatum*)+TX、盾殼黴(*Coniothyrium minitans*)(Cotans WG®)+TX、盾殼黴屬物種(*Coniothyrium spp.*)+TX、淺白隱球酵母(*Cryptococcus albidus*)(YIELDPLUS®)+TX、土生隱球菌(*Cryptococcus humicola*)+TX、隱球酵母屬 *infirmitus*+TX、羅倫隱球酵母(*Cryptococcus laurentii*)+TX、蘋果異形

小卷蛾顆粒體病毒 (Cryptophlebia leucotreta granulovirus) (Cryptex®) + TX、
 Cupriavidus campinensis+ TX、蘋果蠹蛾顆粒體病毒 (Cydia pomonella
 granulovirus) (CYD-X®) + TX、蘋果蠹蛾顆粒體病毒 (Madex® + TX、Madex
 Plus® + TX、Madex Max/ Carpovirusine®) + TX、Cylindrobasidium laeve
 (Stumpout®) + TX、枝雙孢黴屬 (Cylindrocladium) + TX、漢遜德巴厘酵母
 (Debaryomyces hansenii) + TX、Drechslera hawaiiensis + TX、陰溝腸桿菌
 (Enterobacter cloacae) +TX、腸桿菌科 (Enterobacteriaceae) + TX、毒力蟲黴
 (Entomophthora virulenta) (Vektor®) + TX、附球菌 (Epicoccum nigrum) + TX、
 黑附球菌 (Epicoccum purpurascens) + TX、附球菌屬物種+ TX、Filobasidium
 floriforme+ TX、銳頂鏟孢菌+ TX、厚孢鏟刀菌+ TX、尖孢鏟刀菌 (Fusaclean®/
 Biofox C®) + TX、層出鏟刀菌+ TX、鏟刀菌屬物種+ TX、白地黴 (Galactomyces
 geotrichum) + TX、鏈孢黏帚黴 (Gliocladium catenulatum) (Primastop® + TX、
 Prestop®) + TX、粉紅黏帚黴 (Gliocladium roseum) + TX、黏帚黴屬物種
 (SoilGard®) + TX、綠黏帚黴 (Soilgard®) + TX、顆粒體病毒 (Granupom®)
 + TX、嗜鹽鹽芽孢桿菌 (Halobacillus halophilus) + TX、岸喜鹽芽孢桿菌
 (Halobacillus litoralis) + TX、特氏鹽芽孢桿菌 (Halobacillus trueperi) + TX、鹽
 單胞菌屬物種 + TX、冰下鹽單胞菌 (Halomonas subglaciescola) + TX、多變鹽
 弧菌 (Halovibrio variabilis) + TX、葡萄汁有孢漢遜酵母 + TX、棉鈴蟲核型多角
 體病毒 (Helicovex®) + TX、穀實夜蛾核型多角體病毒 (Gemstar®) + TX、異
 黃酮-芒柄花黃素 (Myconate®) + TX、檸檬克勒克酵母 + TX、克勒克酵母屬物
 種 + TX、大鏈壺菌 (Lagenidium giganteum) (Laginex®) + TX、長孢蠟蚧菌
 (Lecanicillium longisporum) (Vertiblast®) + TX、蠟蚧疥黴 (Lecanicillium
 muscarium) (Vertikil®) + TX、舞毒蛾核型多角體病毒 (Disparvirus®) + TX、
 嗜鹽海球菌 + TX、格氏梅拉菌 (Meira geulakonigii) + TX、綠僵菌 (Met52®)

+ TX、綠僵菌 (Destruxin WP®) + TX、Metschnikowia fruticola (Shemer®) + TX、美極梅奇酵母 (Metschnikowia pulcherrima) + TX、Microdochium dimerum (Antibot®) + TX、天藍色小單孢菌 (Micromonospora coerulea) + TX、Microsphaeropsis ochracea + TX、惡臭白色真菌 (Muscodor albus) 620 (Muscudor®) + TX、Muscodor roseus 菌株A3-5 + TX、菌根屬物種 (Mycorrhizae spp.) (AMykor® + TX、Root Maximizer®) + TX、疣孢漆斑菌菌株AARC-0255 (DiTera®) + TX、BROS PLUS® + TX、Ophiostoma piliferum 菌株D97 (Sylvanex®) + TX、粉質擬青黴 (Paecilomyces farinosus) + TX、玫煙色擬青黴 (PFR-97® + TX、PreFeRal®) + TX、淡紫擬青黴 (Paecilomyces lilacinus) (Biostat WP®) + TX、淡紫擬青黴菌株251 (MeloCon WG®) + TX、多黏類芽孢桿菌 + TX、成團泛菌 (BlightBan C9-1®) + TX、泛菌屬物種 + TX、巴斯德氏芽菌屬物種 (Econem®) + TX、擬斯紮瓦巴氏桿菌 (Pasteuria nishizawae) + TX、黃灰青黴 + TX、拜賴青黴 (Penicillium billai) (Jumpstart® + TX、TagTeam®) + TX、短密青黴 + TX、常現青黴 + TX、灰黃青黴 + TX、產紫青黴 + TX、青黴菌屬物種 + TX、純綠色肯黴 + TX、大伏革菌 (Phlebiopsis gigantea) (Rotstop®) + TX、解磷細菌 (Phosphomeal®) + TX、隱地疫黴 + TX、棕櫚疫黴 (Devine®) + TX、異常畢赤酵母 + TX、季也蒙畢赤酵母 (Pichia guillemontii) + TX、膜醭畢赤氏酵母 + TX、指甲畢赤酵母 + TX、樹幹畢赤酵母 + TX、銅綠假單胞菌 + TX、致金色假單胞菌 (Pseudomonas aureofasciens) (Spot-Less Biofungicide®) + TX、洋蔥假單胞菌 + TX、綠針假單胞菌 (AtEze®) + TX、皺褶假單胞菌 (Pseudomonas corrugate) + TX、螢光假單胞菌菌株A506 (BlightBan A506®) + TX、惡臭假單胞菌 + TX、Pseudomonas reactans + TX、假單胞菌屬物種 + TX、丁香假單胞菌 (Bio-Save®) + TX、綠黃假單胞菌 + TX、螢光假單胞菌 (Zequanox®) + TX、Pseudozyma flocculosa 菌株PF-A22 UL (Sporodex L®) + TX、縱溝柄鏽菌 (Puccinia canaliculata)

+ TX、Puccinia thlaspeos(Wood Warrior®)+ TX、側雄腐黴菌(Pythium oligandrum)
 + TX、寡雄腐黴(Polygandron® + TX、Polyversum®) + TX、纏器腐黴+ TX、水生拉恩菌(Rhanella aquatilis) + TX、拉恩菌屬物種(Rhanella spp.) + TX、根瘤菌(Rhizobia)(Dormal® + TX、Vault®) + TX、絲核菌(Rhizoctonia) + TX、球狀紅球菌(Rhodococcus globerulus) 菌株AQ719 + TX、雙倒卵形紅冬孢酵母菌(Rhodosporidium diobovatum) + TX、圓紅冬孢酵母菌(Rhodosporidium toruloides) + TX、紅酵母屬物種(Rhodotorula spp.) + TX、黏紅酵母(Rhodotorula glutinis) + TX、禾本紅酵母(Rhodotorula graminis) + TX、膠紅酵母(Rhodotorula mucilagnosa) + TX、深紅酵母(Rhodotorula rubra) + TX、釀酒酵母(Saccharomyces cerevisiae) + TX、玫瑰色鹽水球菌(Salinococcus roseus) + TX、小核盤菌(Sclerotinia minor) + TX、小核盤菌(SARRITOR®) + TX、柱頂孢黴屬物種(Scytalidium spp.) + TX、Scytalidium uredinicola + TX、甜菜夜蛾核型多角體病毒(Spodoptera exigua nuclear polyhedrosis virus)(Spod-X® + TX、Spexit®) + TX、黏質沙雷氏菌(Serratia marcescens) + TX、普城沙雷菌(Serratia plymuthica) + TX、沙雷氏菌屬物種(Serratia spp.) + TX、糞生糞殼菌(Sordaria fimicola) + TX、海灰翅夜蛾核型多角體病毒(Spodoptera littoralis nucleopolyhedrovirus)(Littovir®) + TX、紅擲孢酵母(Sporobolomyces roseus) + TX、嗜麥芽寡養單胞菌(Stenotrophomonas maltophilia) + TX、不吸水鏈黴菌(Streptomyces ahygroscopicus) + TX、白丘鏈黴菌(Streptomyces albaduncus) + TX、脫葉鏈黴菌(Streptomyces exfoliates) + TX、鮮黃鏈黴菌(Streptomyces galbus) + TX、灰平鏈黴菌(Streptomyces griseoplanus) + TX、灰綠鏈黴菌(Streptomyces griseoviridis)(Mycostop®) + TX、利迪鏈黴菌(Streptomyces lydicus)(Actinovate®) + TX、利迪鏈黴菌WYEC-108(ActinoGrow®) + TX、紫色鏈黴菌(Streptomyces violaceus) + TX、小鐵艾酵母(Tilletiopsis minor) + TX、鐵艾

酵母屬物種 (*Tilletiopsis* spp.) + TX、棘孢木黴 (*Trichoderma asperellum*) (T34 Biocontrol®) + TX、蓋姆斯木黴 (*Trichoderma gamsii*) (Tenet®) + TX、深綠木黴 (*Trichoderma atroviride*) (Plantmate®) + TX、鉤狀木黴 (*Trichoderma hamatum*) TH 382 + TX、哈茨木黴 (*Trichoderma harzianum rifai*) (Mycostar®) + TX、哈茨木黴 (*Trichoderma harzianum*) T-22 (Triatum-P® + TX、PlantShield HC® + TX、RootShield® + TX、Triatum-G®) + TX、哈茨木黴 (*Trichoderma harzianum*) T-39 (Trichodex®) + TX、非鉤木黴 (*Trichoderma inhamatum*) + TX、康寧木黴 (*Trichoderma koningii*) + TX、木黴屬物種 (*Trichoderma* spp.) LC 52 (Sentinel®) + TX、木素木黴 (*Trichoderma lignorum*) + TX、長柄木黴 (*Trichoderma longibrachiatum*) + TX、多孢木黴 (*Trichoderma polysporum*) (Binab T®) + TX、紫杉木黴 (*Trichoderma taxi*) + TX、綠色木黴 (*Trichoderma virens*) + TX、綠色木黴 (原來稱為綠色黏帚黴 (*Gliocladium virens*) GL-21) (SoilGuard®) + TX、綠色木黴 (*Trichoderma viride*) + TX、綠色木黴菌株 ICC 080 (Remedier®) + TX、茁芽絲孢酵母 (*Trichosporon pullulans*) + TX、毛孢子菌屬物種 (*Trichosporon* spp.) + TX、單端孢屬物種 (*Trichothecium* spp.) + TX、粉紅單端孢 (*Trichothecium roseum*) + TX、*Typhula phacorrhiza* 菌株 94670 + TX、*Typhula phacorrhiza* 菌株 94671 + TX、黑細基格孢 (*Ulocladium atrum*) + TX、奧德曼細基格孢 (*Ulocladium oudemansii*) (Botry-Zen®) + TX、玉蜀黍黑粉菌 (*Ustilago maydis*) + TX、各種細菌和補充微量營養素 (Natural II®) + TX、各種真菌 (Millennium Microbes®) + TX、厚垣輪枝孢菌 (*Verticillium chlamydosporium*) + TX、蠟蚧輪枝菌 (*Verticillium lecanii*) (Mycotal® + TX、Vertalec®) + TX、Vip3Aa20 (VIPTera®) + TX、死海枝芽孢桿菌 (*Virgibacillus marismortui*) + TX、野油菜黃單胞菌 pv. *Poa* (Camperico®) + TX、伯氏致病桿菌 + TX、嗜線蟲致病桿菌；

【0519】 植物萃取物，包括：松樹油 (Retenol®) + TX、印棟素 (Plasma

Neem Oil®+ TX、AzaGuard®+ TX、MeemAzal®+ TX、Molt-X®+ TX、植物IGR (Neemazad®+ TX、Neemix®) + TX、芥花油 (Lilly Miller Vegol®) + TX、土荊芥 (Chenopodium ambrosioides near ambrosioides) (Requiem®) + TX、菊花萃取物 (Crisant®) + TX、印楝油萃取物 (Trilogy®) + TX、唇形科 (Labiatae) 精油 (Botania®) + TX、丁香-迷迭香-胡椒薄荷和百里香油萃取物 (Garden insect killer®) + TX、甜菜鹼 (Greenstim®) + TX、大蒜+ TX、檸檬草油 (GreenMatch®) + TX、印楝油+ TX、貓薄荷 (Nepeta cataria) (貓薄荷油) + TX、*Nepeta catarina*+ TX、菸鹼+ TX、牛至油 (MossBuster®) + TX、胡麻科 (Pedaliaceae) 油 (Nematon®) + TX、除蟲菊+ TX、皂皮樹 (*Quillaja saponaria*) (NemaQ®) + TX、大虎杖 (*Reynoutria sachalinensis*) (Regalia®+ TX、Sakalia®) + TX、魚藤酮 (Eco Roten®) + TX、芸香科 (Rutaceae) 植物萃取物 (Soleo®) + TX、大豆油 (Ortho ecosense®) + TX、茶樹油 (Timorex Gold®) + TX、百里香油+ TX、AGNIQUE® MMF+ TX、BugOil®+ TX、迷迭香-芝麻-胡椒薄荷-百里香和肉桂萃取物混合物 (EF 300®) + TX、丁香-迷迭香和胡椒薄荷萃取物混合物 (EF 400®) + TX、丁香-胡椒薄荷-大蒜油和薄荷混合物 (Soil Shot®) + TX、高嶺土 (Screen®) + TX、褐藻的貯存葡聚糖 (Laminarin®)；

【0520】 資訊素，包括：黑頭螢火蟲資訊素 (3M Sprayable Blackheaded Fireworm Pheromone®) + TX、蘋果蠹蛾資訊素 (Paramount dispenser-(CM)/ Isomate C-Plus®) + TX、葡萄小卷葉蛾資訊素 (3M MEC-GBM Sprayable Pheromone®) + TX、卷葉蟲資訊素 (3M MEC – LR Sprayable Pheromone®) + TX、家蠅資訊素 (Muscamone) (Snip7 Fly Bait® + TX、Starbar Premium Fly Bait®) + TX、梨小食心蟲資訊素 (3M oriental fruit moth sprayable pheromone®) + TX、桃透翅蛾 (Peachtree Borer) 資訊素 (Isomate-P®) + TX、番茄蟻蟲 (Tomato Pinworm) 資訊素 (3M Sprayable pheromone®) + TX、衣透斯特粉末 (Entostat

powder) (來自棕櫚樹的萃取物) (Exosex CM®) + TX、(E + TX,Z + TX,Z)-3 + TX,8 + TX,11十四碳三烯乙酸酯+ TX、(Z + TX,Z + TX,E)-7 + TX,11 + TX,13-十六三烯醛+ TX、(E + TX,Z)-7 + TX,9-十二碳二烯-1-基乙酸酯+ TX、2-甲基-1-丁醇+ TX、乙酸鈣+ TX、Scenturion® + TX、Biolure® + TX、Check-Mate® + TX、薰衣草千里酸酯 (Lavandulyl senecioate)；

【0521】 宏生物劑 (Macrobial)，包括：短距蚜小蜂 + TX、阿爾蚜繭蜂 (*Aphidius ervi*) (Aphelinus-System®) + TX、*Acerophagus papaya* + TX、二星瓢蟲 (Adalia-System®) + TX、二星瓢蟲 (Adaline®) + TX、二星瓢蟲 (Aphidalia®) + TX、串繭跳小蜂 (*Ageniaspis citricola*) + TX、巢蛾多胚跳小蜂 + TX、安德森鈍綫蟎 (*Amblyseius andersoni*) (Anderline® + TX、Andersoni-System®) + TX、加州鈍綫蟎 (*Amblyseius californicus*) (Amblyline® + TX、Spical®) + TX、黃瓜鈍綫蟎 (Thripex® + TX、Bugline cucumeris®) + TX、偽鈍綫蟎 (Fallacis®) + TX、斯氏鈍綫蟎 (Bugline swirskii® + TX、Swirskii-Mite®) + TX、奧氏鈍綫蟎 (WomerMite®) + TX、粉虱細蜂 (*Amitus hesperidum*) + TX、原櫻翅繭小蜂 (*Anagrus atomus*) + TX、暗腹長索跳小蜂 (*Anagrus fusciventris*) + TX、卡瑪長索跳小蜂 (*Anagrus kamali*) + TX、*Anagrus loeckii* + TX、粉蚧長索跳小蜂 (*Anagrus pseudococci*) (Citripar®) + TX、紅蠟蚧扁角跳小蜂 (*Anicetus benefices*) + TX、金小蜂 (*Anisopteromalus calandrae*) + TX、林地花蝽 (*Anthocoris nemoralis*) (Anthocoris-System®) + TX、短距蚜小蜂 (Apheline® + TX、Aphiline®) + TX、短翅蚜小蜂 (*Aphelinus asychis*) + TX、棉蚜寄生蜂 (*Aphidius colemani*) (Ahipar®) + TX、阿爾蚜繭蜂 (Ervipar®) + TX、煙蚜繭蜂 + TX、桃赤蚜蚜繭蜂 (Ahipar-M®) + TX、食蚜瘿蚊 (Aphidend®) + TX、食蚜瘿蚊 (Aphidoline®) + TX、嶺南黃蚜小蜂 + TX、印巴黃蚜小蜂 + TX、哈氏長尾鬚小蜂 (*Aprostocetus hagenowii*) + TX、蟻形隱翅甲 (*Atheta coriaria*) (Staphyline®) + TX、熊蜂屬物

種 + TX、歐洲熊蜂(Natupol Beehive®)+ TX、歐洲熊蜂(Beeline® + TX、Tripol®)
+ TX、*Cephalonomia stephanoderis* + TX、黑背唇瓢蟲(*Chilocorus nigritus*) + TX、
普通草蛉(*Chrysoperla carnea*) (Chrysoline®) + TX、普通草蛉(Chrysopa®)
+ TX、紅通草蛉(*Chrysoperla rufilabris*) + TX、*Cirrospilus ingenuus* + TX、四帶
瑟姬小蜂(*Cirrospilus quadristriatus*) + TX、白星橘齧小蜂(*Citrostichus
phyllocnistoides*) + TX、*Closterocerus chamaeleon* + TX、*Closterocerus*屬物種 +
TX、*Coccidoxenoides perminutus* (Planopar®) + TX、泊蚜小蜂(*Coccophagus
cowperi*) + TX、賴食蚧蚜小蜂(*Coccophagus lycimnia*) + TX、螟黃足盤絨繭蜂
+ TX、菜蛾絨繭蜂 + TX、孟氏隱唇瓢蟲(Cryptobug® + TX、Cryptoline®) + TX、
日本方頭甲 + TX、西伯利亞離顎繭蜂 + TX、西伯利亞離顎繭蜂(Minusa®) +
TX、豌豆潛葉蠅姬小蜂(Diminex®) + TX、小黑瓢蟲(*Delphastus catalinae*)
(Delphastus®) + TX、*Delphastus pusillus* + TX、*Diachasmimorpha krausii* + TX、
長尾潛蠅繭蜂 + TX、*Diaparsis jucunda* + TX、阿裡食虱跳小蜂(*Diaphorencyrtus
aligarhensis*) + TX、豌豆潛葉蠅姬小蜂 + TX、豌豆潛葉蠅姬小蜂(Miglyphus®
+ TX、Digline®) + TX、西伯利亞離顎繭蜂(DacDigline® + TX、Minex®) + TX、
歧脈跳小蜂屬物種 + TX、盾蚧長纓蚜小蜂 + TX、麗蚜小蜂(*Encarsia max*® +
TX、Encarline® + TX、En-Strip®) + TX、漿角蚜小蜂(*Eretmocerus eremicus*)
(Enermix®) + TX、哥德恩蚜小蜂(*Encarsia guadeloupeae*) + TX、海地恩蚜小
蜂(*Encarsia haitiensis*) + TX、細餛飩蚜蠅(Syrphidend®) + TX、*Eretmoceris
siphonini* + TX、加州漿角蚜小蜂(*Eretmocerus californicus*) + TX、漿角蚜小蜂
(*Eretmocerus eremicus*) (Ercal® + TX、Eretline e®) + TX、漿角蚜小蜂
(*Eretmocerus eremicus*) (Bemimix®) + TX、海氏漿角蚜小蜂 + TX、蒙氏漿角
蚜小蜂(Bemipar® + TX、Eretline m®) + TX、*Eretmocerus siphonini* + TX、四斑
光緣瓢蟲(*Exochomus quadripustulatus*) + TX、食蟻癭蚊(*Feltiella acarisuga*)

(Spidend®) + TX、食蟻癭蚊 (Feltiline®) + TX、阿里山潛蠅繭蜂 + TX、*Fopius ceratitivorus* + TX、芒柄花黃素 (Wirless Beehome®) + TX、細腰凶薊馬 (Vespop®) + TX、西方靜走蟻 (*Galendromus occidentalis*) + TX、萊氏棱角腫腿蜂 (*Goniozus legneri*) + TX、麥蛾柔繭蜂 + TX、異色瓢蟲 (HarmoBeetle®) + TX、異小桿線蟲屬物種 (Lawn Patrol®) + TX、嗜菌異小桿線蟲 (NemaShield HB® + TX、Nemaseek® + TX、Terranem-Nam® + TX、Terranem® + TX、Larvanem® + TX、B-Green® + TX、NemAttack® + TX、Nematop®) + TX、大異小桿線蟲 (*Heterorhabditis megidis*) (Nemasys H® + TX、BioNem H® + TX、Exhibitline hm® + TX、Larvanem-M®) + TX、斑長足瓢蟲 (*Hippodamia convergens*) + TX、尖狹下盾蟻 (*Hypoaspis aculeifer*) (Aculeifer-System® + TX、Entomite-A®) + TX、兵下盾蟻 (*Hypoaspis miles*) (Hypoline m® + TX、Entomite-M®) + TX、黑色枝跗癭蜂 + TX、*Lecanoideus floccissimus* + TX、*Lemophagus errabundus* + TX、三色麗突跳小蜂 (*Leptomastidea abnormis*) + TX、橘粉介殼蟲寄生蜂 (*Leptomastix dactylopii*) (Leptopar®) + TX、長角跳小蜂 (*Leptomastix epona*) + TX、*Lindorus lophanthae* + TX、*Lipolexis oregmae* + TX、叉葉綠蠅 (Natufly®) + TX、茶足柄瘤蚜繭蜂 + TX、盲蝽 (*Macrolophus caliginosus*) (Mirical-N® + TX、Macroline c® + TX、Mirical®) + TX、*Mesoseiulus longipes* + TX、黃色闊柄跳小蜂 (*Metaphycus flavus*) + TX、*Metaphycus lounsburyi* + TX、角紋脈褐蛉 (Milacewing®) + TX、黃色花翅跳小蜂 (*Microterys flavus*) + TX、*Muscidifurax raptorellus* 和 *Spalangia cameroni* (Biopar®) + TX、*Neodryinus typhlocybae* + TX、加州新小綏蟻 + TX、黃瓜新小綏蟻 (THRYPEX®) + TX、偽新小綏蟻 (*Neoseiulus fallacis*) + TX、*Nesideocoris tenuis* (NesidioBug® + TX、Nesibug®) + TX、古銅黑蠅 (Biofly®) + TX、狡小花蝽 (*Orius insidiosus*) (Thripor-I® + TX、Oriline i®) + TX、無毛小花蝽 (*Orius laevigatus*) (Thripor-L® + TX、Oriline l®) + TX、大臀小花蝽 (*Orius*

majusculus) (Oriline m®) + TX、小黑花椿象 (Thripor-S®) + TX、*Pauesia juniperorum* + TX、瓢蟲柄腹姬小蜂 (*Pediobius foveolatus*) + TX、*Phasmarhabditis hermaphrodita* (Nemaslug®) + TX、*Phymastichus coffea* + TX、粗毛小植綫蟎 (*Phytoseiulus macropilus*) + TX、智利小植綫蟎 (Spidex® + TX、Phytoline p®) + TX、斑腹刺益蝽 (Podisus®) + TX、寄生性蚤蠅 (*Pseudacteon*) *curvatus* + TX、寄生性蚤蠅 (*Pseudacteon*) *obtusus* + TX、寄生性蚤蠅 (*Pseudacteon*) *tricuspis* + TX、*Pseudaphycus maculipennis* + TX、*Pseudleptomastix mexicana* + TX、具毛嗜木虱跳小蜂 (*Psyllaephagus pilosus*) + TX、同色短背繭蜂 (*Psytalia concolor*) (複合物) + TX、胯姬小蜂屬物種 (*Quadrastichus* spp.) + TX、*Rhyzobius lophanthae* + TX、澳洲瓢蟲 + TX、*Rumina decollate* + TX、*Semielacher petiolatus* + TX、麥長管蚜 (Ervibank®) + TX、小卷蛾斯氏線蟲 (Nematac C® + TX、Millenium® + TX、BioNem C® + TX、NemAttack® + TX、Nemastar® + TX、Capsanem®) + TX、夜蛾斯氏線蟲 (NemaShield® + TX、Nemasys F® + TX、BioNem F® + TX、Steinernema-System® + TX、NemAttack® + TX、Nemaplus® + TX、Exhibitline sf® + TX、Scia-rid® + TX、Entonem®) + TX、鋸蜂線蟲 (*Steinernema kraussei*) (Nemasys L® + TX、BioNem L® + TX、Exhibitline srb®) + TX、銳比斯氏線蟲 (*Steinernema riobrave*) (BioVector® + TX、BioVektor®) + TX、螻蛄斯氏線蟲 (*Steinernema scapterisci*) (Nematac S®) + TX、斯氏線蟲屬物種 + TX、斯氏科 (*Steinernematid*) 屬物種 (Guardian Nematodes®) + TX、深點食蟎瓢蟲 (Stethorus®) + TX、亮腹絨小蜂 + TX、*Tetrastichus setifer* + TX、*Thripobius semiluteus* + TX、中華長尾小蜂 (*Torymus sinensis*) + TX、甘藍夜蛾赤眼蜂 (Tricholine b®) + TX、甘藍夜蛾赤眼蜂 (Tricho-Strip®) + TX、廣赤眼蜂 + TX、微小赤眼蜂 + TX、玉米螟赤眼蜂 + TX、寬脈赤眼蜂 (*Trichogramma platneri*) + TX、短管赤眼蜂 + TX、螟黑點瘤姬蜂 (*Xanthopimpla stemmator*) ;

【0522】 其他生物製劑，包括：脫落酸 + TX、bioSea® + TX、銀葉菌 (*Chondrostereum purpureum*) (Chontrol Paste®) + TX、盤長孢狀刺盤孢 (Collego®) + TX、辛酸銅 (Cueva®) + TX、 δ 捕捉物 (Delta trap) (Trapline d®) + TX、解澱粉歐文氏菌 (Harpin) (ProAct® + TX、Ni-HIBIT Gold CST®) + TX、磷酸高鐵 (Ferramol®) + TX、漏斗捕捉物 (Funnel trap) (Trapline y®) + TX、Gallex® + TX、Grower's Secret® + TX、高油菜素內酯 (Homo-brassonolide) + TX、磷酸鐵 (Lilly Miller Worry Free Ferramol Slug & Snail Bait®) + TX、MCP冰雹捕捉物 (hail trap) (Trapline f®) + TX、寄生性昆蟲南美食甲繭蜂 (*Microctonus hyperodae*) + TX、*Mycoleptodiscus terrestris* (Des-X®) + TX、BioGain® + TX、Aminomite® + TX、Zenox® + TX、資訊素羅網 (Thripline ams®) + TX、碳酸氫鉀 (MilStop®) + TX、脂肪酸的鉀鹽 (Sanova®) + TX、矽酸鉀溶液 (Sil-Matrix®) + TX、碘化鉀 + 硫氰酸鉀 (Enzicur®) + TX、SuffOil-X® + TX、蜘蛛毒 + TX、蝗蟲微孢子蟲 (Semaspore Organic Grasshopper Control®) + TX、黏捕捉物 (Trapline YF® + TX、Rebell Amarillo®) + TX以及捕捉物 (Takitrapline y + b®) + TX；以及

【0523】 安全劑，如解草啉 + TX、解草酯 (包括解草酯-甲基) + TX、環丙磺醯胺 + TX、二氯丙烯胺 + TX、解草唑 (包括解草唑-乙基) + TX、解草啞 + TX、氟草脞 + TX、解草啞唑 + TX、雙苯啞唑酸 (包括雙苯啞唑酸-乙基) + TX、吡啶解草酯 (mefenpyr) (包括吡啶解草酯-二乙基) + TX、metcamifen + TX和解草脞 + TX。

【0524】 在活性成分之後的括弧中的參考，例如[3878-19-1]係指化學文摘登記號。上文描述的混合配伍物係已知的。當活性成分包括在「The Pesticide Manual [殺有害生物劑手冊]」The Pesticide Manual - A World Compendium [殺有害生物劑手冊-全球概覽]；第13版；編輯：C.D. S. TomLin；The British Crop

Protection Coimcil [英國農作物保護委員會]中，它們在其中以上文的特定化合物的圓括號中所給出的編號來描述；例如化合物「阿巴美丁」以編號 (1) 來描述。其中「[CCN]」係對於上文的特定化合物來加上的，該的化合物包括在「Compendium of Pesticide Common Names[殺有害生物通用名概要]」中，其可以在互聯網[A. Wood；Compendium of Pesticide Common Names，Copyright © 1995-2004]上獲得；例如，化合物「乙醯蟲腈」描述於互聯網地址 <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html> 中。

【0525】 多數活性成分藉由上文中所謂的「通用名」來表示，在不同的情形中使用相應的「ISO通用名」或其它「通用名」。若名稱不是「通用名」，則所使用的名稱種類以特定化合物的圓括號中所給出的名稱來代替；在這種情況下，使用IUPAC名稱、IUPAC/化學文摘名、「化學名稱」、「慣用名」、「化合物名稱」或「發展代碼」，或若既不使用那些名稱之一也不使用「通用名」，則使用「別名」。「CAS登記號」意指化學文摘登記號。

【0526】 選自表A-1至A-60和表B-1至B-60和表P的具有式I之化合物與上述活性成分的活性成分混合物包含選自表A-1至表A-60和表B-1至B-60和表P的化合物和如上所述之活性成分，該化合物和該活性成分較佳的是處於從100:1至1:6000，尤其是從50:1至1:50的混合比，更尤其是處於從20:1至1:20的比率，甚至更尤其是從10:1至1:10，非常尤其是從5:1和1:5的比率，特別較佳的從2:1至1:2的比率，並且同樣較佳的是從4:1至2:1的比率，尤其是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。那些混合比率係按重量計的。

【0527】 如上所述之混合物可以被用於控制有害生物之方法中，該方法包括將含如上文所述之混合物的組成物施用於有害生物或其環境中，藉由手術或療法用於處理人或動物體之方法以及在人或動物體上實施的診斷方法除外。

【0528】 包含選自表A-1至A-60和表B-1至B-60和表P的具有式I之化合物和一種或多種如上所述之活性成分的混合物可以例如如下施用：以單一的「摻水即用」的形式，以組合式噴霧混合物（該混合物由單一活性成分組分的單獨配製物構成，例如「桶混劑」），以及當以順序方式（即，一個在另一個適度短的時間段之後，如幾小時或幾天）施用時組合使用該等單一活性成分。施用選自表A-1至A-60和表B-1至B-60和表P的具有式I之化合物和如上文所述之活性成分的順序對於實施本發明並不是至關重要的。

【0529】 根據本發明的組成物還可以包含其他固體或液體助劑，如穩定劑，例如未環氧化的或環氧化的植物油（例如環氧化的椰子油、菜籽油或大豆油），消泡劑（例如矽酮油），防腐劑，黏度調節劑，黏合劑和/或增黏劑，肥料或其他用於獲得特定效果的活性成分，例如殺細菌劑、殺真菌劑、殺線蟲劑、植物活化劑、殺軟體動物劑或除草劑。

【0530】 根據本發明的組成物係以本身已知的方式，在不存在助劑的情況下，例如藉由研磨、篩選和/或壓縮固體活性成分；和在至少一種助劑的存在下，例如藉由緊密混合活性成分與一種或多種助劑和/或將活性成分與一種或多種助劑一起研磨來製備。用於製備組成物的該等方法和用於製備該等組成物的化合物I之用途也是本發明的主題。

【0531】 該等組成物的施用方法，即控制上述類型的有害生物之方法，如噴霧、霧化、撒粉、刷塗、包衣、撒播或澆灌-它們被選擇以適於普遍情況的預期目的-以及該等組成物用於控制上述類型的有害生物之用途係本發明的其他主題。典型的濃度比係在0.1與1000 ppm之間、較佳的是在0.1與500 ppm之間的活

性成分。每公頃的施用量總體上係每公頃1 g至2000 g活性成分、尤其是10 g/ha至1000 g/ha、較佳的是係10 g/ha至600 g/ha。

【0532】 在作物保護領域中，較佳的施用方法係施用至該等植物的葉（葉施用），可能的是選擇施用的頻率和比率以符合所討論的有害生物的侵染風險。可替代地，該活性成分可以藉由根系統（內吸作用）到達植物，這係藉由用液體組成物將該等植物的場所浸透或者藉由將呈固體形式的活性成分引入植物的場所（例如引入土壤，例如以顆粒的形式（土施））來實現的。在水稻作物的情況下，這樣的顆粒劑可以被計量地加入淹水的稻田中。

【0533】 本發明的化合物及其組成物還適合於植物繁殖材料（例如種子，像果實、塊莖或籽粒，或者苗圃植物）的保護，以對抗上述類型的有害生物。可以用該化合物在種植前對該繁殖材料進行處理，例如可以在播種前對種子進行處理。可替代地，該化合物可以施用至種子籽粒（包衣），這係藉由將籽粒浸漬入液體組成物中或藉由施用固體組成物層實現的。還可能在該繁殖材料被種植在施用場地時施用該等組成物，例如在條播期間將該等組成物施入種子犁溝。該等用於植物繁殖材料的處理方法和如此處理的植物繁殖材料係本發明另外的主題。典型的處理比率將取決於植物以及有待控制的有害生物/真菌，並且通常在每100 kg種子1克至200克之間、較佳的是在每100 kg種子5克至150克之間，如在每100 kg種子10克至100克之間。

【0534】 術語種子包括所有種類的種子以及植物繁殖體，包括但並不限於真正的種子、種塊、根蘖、穀粒、鱗球莖、果實、塊莖、穀物、根莖、插條、切割枝條以及類似物並且在較佳的實施方式中意指真正的種子。

【0535】 本發明還包括經具有式I之化合物包衣或處理或含有具有式I之化合物的種子。儘管取決於施用之方法成分的更多或更少的部分可以滲透到該種子材料中，術語「包衣或處理和/或含有」通常表示在施用的時候，在大多數

情況下，該活性成分在該種子的表面。當所述種子產品被（再）種植時，它可以吸收活性成分。在實施方式中，本發明使得其上黏附有具有式 (I) 之化合物的植物繁殖材料可供使用。此外，由此使得包括用具有式 (I) 之化合物處理過的植物繁殖材料的組成物可供使用。

【0536】 種子處理包括本領域中已知的所有適合的種子處理技術，如拌種、種子包衣、種子撒粉、浸種以及種子造粒。可以藉由任何已知之方法進行具有式 (I) 之化合物的種子處理施用，如在種子播種之前或播種/種植過程中對種子進行噴霧或藉由撒粉。

生物學實例：

【0537】 接下來的實例用來說明本發明。本發明的某些化合物與已知的化合物的區別可以在於在低施用率下更大的功效，這可以由熟悉該項技術者使用在實例中概述的實驗程序，使用更低的施用率（如果必要的話）例如，50 ppm、12.5 ppm、6 ppm、3 ppm、1.5 ppm、0.8 ppm或0.2 ppm來證實。

實例B1：對抗黃瓜條葉甲 (*Diabrotica balteata*) (玉米根蟲) 的活性

【0538】 將24孔微量滴定板中的置於瓊脂層上的玉米芽藉由噴霧用從10'000 ppm DMSO儲備溶液製備的水性測試溶液進行處理。在乾燥之後，用L2期幼蟲對板進行侵染（6至10隻/孔）。侵染4天之後，相比於未處理樣品，針對死亡率和生長抑制對該等樣品進行評估。

【0539】 以下化合物在200 ppm施用率下給出了兩個類別（死亡率或生長抑制）中至少一個的至少80%的效果：P2、P3、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P15。

實例B2：對抗小菜蛾 (*Plutella xylostella*) (小菜蛾 (Diamond back moth)) 的活性

【0540】 將具有人工飼料的24孔微量滴定板用從10'000 ppm DMSO儲備

溶液製備的水性測試溶液藉由移液進行處理。在乾燥之後，將菜蛾屬卵吸移穿過塑膠模板到凝膠印跡紙上並且用其封閉板。侵染8天之後，相比於未處理樣品，針對死亡率和生長抑制對該等樣品進行評估。

【0541】 以下化合物在200 ppm施用率下給出了兩個類別（死亡率或生長抑制）中至少一個的至少80%的效果：P2、P3、P4、P5、P6、P8、P13。

實例B3：對抗桃蚜（綠色桃蚜蟲）的活性，攝食/接觸活性

【0542】 將向日葵葉圓片置於24孔微量滴定板中的瓊脂上並且用從10'000 ppm DMSO儲備溶液製備的水性測試溶液進行噴霧。乾燥之後，用混合年齡的蚜蟲種群對葉圓片進行侵染。侵染6天之後，針對死亡率對該等樣品進行評估。

【0543】 以下化合物在200 ppm施用率下產生至少80%的死亡率：P2、P3、P5、P7、P10。

實例B4：對抗桃蚜（綠色桃蚜蟲）的活性，內吸活性

【0544】 將受到混合年齡的蚜蟲種群侵染的豌豆幼苗的根部直接放在從10'000 DMSO儲備溶液製備的水性測試溶液中。將幼苗放置在測試溶液中6天之後，針對死亡率對該等樣品進行評估。

【0545】 以下化合物在24 ppm測試比率下產生至少80%的死亡率：P2、P3、P7。

實例B5：對抗海灰翅夜蛾 (*Spodoptera littoralis*) (埃及棉葉蟲) 的活性

【0546】 將棉花葉圓片置於24孔微量滴定板中的瓊脂上並且用從10'000 ppm DMSO儲備溶液製備的水性測試溶液進行噴霧。在乾燥之後，將葉圓片用五隻L1期幼蟲進行侵染。侵染3天之後，相比於未處理樣品，針對死亡率、拒食效果以及生長抑制對該等樣品進行評估。當該等類別（死亡率、拒食效果和生長抑制）中的至少一個高於未處理的樣品時，實現測試樣品對海灰翅夜蛾的控制。

【0547】 以下化合物在200 ppm施用率下產生至少80%的控制：P2、P3、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P15。

實例B6：對抗二化螟 (*Chilo suppressalis*) (水稻二化螟 (Striped rice stemborer)) 的活性

【0548】 將具有人工飼料的24孔微量滴定板用從10'000 ppm DMSO儲備溶液製備的水性測試溶液藉由移液進行處理。在乾燥之後，用L2期幼蟲對板進行侵染 (6-8隻/孔)。侵染6天之後，相比於未處理樣品，針對死亡率、拒食效果以及生長抑制對該等樣品進行評估。當該等類別(死亡率、拒食效果和生長抑制)中的至少一個高於未處理的樣品時，實現測試樣品對二化螟的控制。

【0549】 以下化合物在200 ppm施用率下產生至少80%的控制：P2、P3、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15。

實例B7：對抗英雄美洲蟥 (*Euschistus heros*) (新熱帶褐臭蟥) 的活性

【0550】 將24孔微量滴定板中的瓊脂上的大豆葉片用從10'000 ppm DMSO儲備溶液製備的水性測試溶液進行噴霧。在乾燥之後，用N2期若蟲對葉片進行侵染。侵染5天之後，相比於未處理樣品，針對死亡率和生長抑制對該等樣品進行評估。

【0551】 以下化合物在200 ppm施用率下給出了兩個類別 (死亡率或生長抑制) 中至少一個的至少80%的效果：P2、P3、P6、P8、P9、P10。

實例B8：對抗蘋果蠹蛾 (*Carpocapsa (Cydia) pomonella*) (蘋果小卷蛾 (Codling moth)) 的活性

【0552】 在施用室中用稀釋的測試溶液對塗覆有石蠟的飲食立方體 (Diet cube) 進行噴灑。在乾燥之後，將處理過的立方體 (10個複製品) 用1隻L1期幼蟲進行侵染。將樣品在26°C-27°C下溫育並且在侵染14天之後，針對死亡率和生長抑制進行檢查。

【0553】 例如，以下化合物在12.5 ppm施用率下產生至少80%的死亡率：
P3、P4、P6。

實例B9：對抗西花薊馬 (*Frankliniella occidentalis*) (西方花薊馬 (Western flower thrips)) 的活性

【0554】 將向日葵葉圓片置於24孔微量滴定板中的瓊脂上並且用從10'000 DMSO儲備溶液製備的水性測試溶液進行噴霧。乾燥之後，用混合年齡的花薊馬種群對葉圓片進行侵染。侵染7天之後，針對死亡率對該等樣品進行評估。

【0555】 以下化合物在200 ppm施用率下產生至少80%的死亡率：P3。

【符號說明】

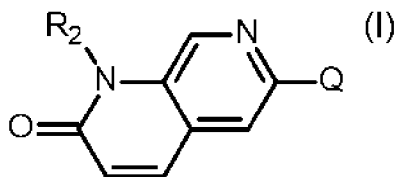
【0556】 無

【生物材料寄存】

【0557】 無

【發明申請專利範圍】

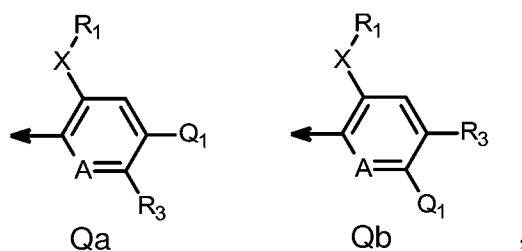
【請求項1】一種具有式 (I) 之化合物，



其中

R₂係C₁-C₆鹵代烷基；

Q係選自由以下組成之群組的基團：式Qa和Qb



其中箭頭指示與雙環的碳原子的附接點；

並且其中A表示CH或N；

X係S、SO或SO₂；

R₁係C₁-C₄烷基或C₃-C₆環烷基-C₁-C₄烷基；

Q₁係氫、鹵素、C₁-C₆鹵代烷基、C₃-C₆環烷基、被氰基單取代的C₃-C₆環烷基、C₁-C₆氰基烷基、C₁-C₆氰基烷氧基、C₁-C₆鹵代烷氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、-N(R₄)CON(R₄)₂、(吡啶啉-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或

Q₁係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至包含取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代或多取代：鹵素、氰基、C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵代烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵代烷氧基、C₁-C₄烷基氫硫基、C₁-C₄烷基亞磺醯基和C₁-C₄烷基磺醯基；並且所述環系統可以含有1、2或3個選自由以下組成之群組的環雜原子：氮、氧和硫，其中所述環系統可以不含有多於一個環氧原子並且不含有多於一個環硫原子；或

Q_1 係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代或多取代：鹵素、氰基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵代烷氧基、 C_1 - C_4 烷基氫硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺醯基和 C_1 - C_4 烷基磺醯基；並且所述環系統含有1、2或3個選自由以下組成之群組的環雜原子：氮、氧和硫，其中所述環系統含有至少一個環氮原子，並且可以不含有多於一個環氧原子並且不含有多於一個環硫原子；

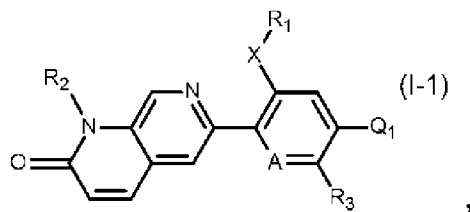
R_3 係氫、鹵素或 C_1 - C_4 烷基；

每個 R_4 獨立地是氫、 C_1 - C_4 烷基或 C_3 - C_6 環烷基；並且

R_5 係 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵代烷基或 C_3 - C_6 環烷基；

或具有式I之化合物的農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物。

【請求項2】如請求項1所述之具有式I之化合物，該化合物由以下表示：具有式 (I-1) 之化合物



其中A、X、 R_1 、和 R_2 係如請求項1中在式I下定義的，或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，並且其中，

Q_1 係氫、鹵素、 C_1 - C_6 鹵代烷基、 C_3 - C_6 環烷基、被氰基單取代的 C_3 - C_6 環烷基、 C_1 - C_6 氰基烷基、 C_1 - C_6 鹵代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(吡啶-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或

Q_1 係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：

鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；或

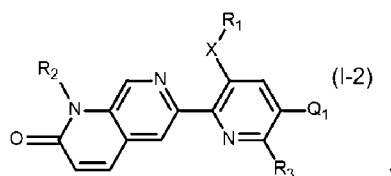
Q₁係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統含有2或3個環氮原子；

R₃係氫或C₁-C₄烷基；

每個R₄獨立地是氫或C₁-C₄烷基；並且

R₅係C₁-C₆烷基或C₃-C₆環烷基。

【請求項3】如請求項1所述之具有式I之化合物，該化合物由以下表示：具有式 (I-2) 之化合物



其中X、R₁和R₂係如請求項1中在式I下定義的，或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，並且其中，

Q₁係氫、鹵素、C₁-C₆鹵代烷基、C₃-C₆環烷基、被氰基單取代的C₃-C₆環烷基、C₁-C₆氰基烷基、C₁-C₆鹵代烷氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、或-N(R₄)CON(R₄)₂、(嗎唑啉-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或

Q₁係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；或

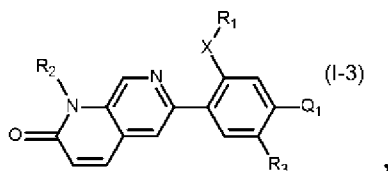
Q₁係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統含有2或3個環氮原子；

R₃係氫或C₁-C₄烷基；

每個R₄獨立地是氫或C₁-C₄烷基；並且

R_5 係 C_1 - C_6 烷基或 C_3 - C_6 環烷基。

【請求項4】如請求項1所述之具有式I之化合物，該化合物由以下表示：具有式 (I-3) 之化合物



其中X、 R_1 和 R_2 係如請求項1中在式I下定義的，或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，並且其中，

Q_1 係氫、鹵素、 C_1 - C_6 鹵代烷基、 C_3 - C_6 環烷基、被氰基單取代的 C_3 - C_6 環烷基、 C_1 - C_6 氰基烷基、 C_1 - C_6 鹵代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(呋唑啉-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或

Q_1 係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和 C_1 - C_4 鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；或

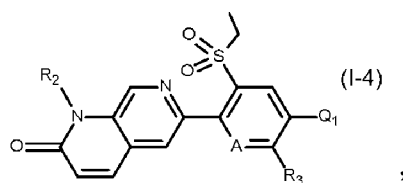
Q_1 係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和 C_1 - C_4 鹵代烷基；並且所述環系統含有2或3個環氮原子；

R_3 係氫或 C_1 - C_4 烷基；

每個 R_4 獨立地是氫或 C_1 - C_4 烷基；並且

R_5 係 C_1 - C_6 烷基或 C_3 - C_6 環烷基。

【請求項5】如請求項1所述之具有式I之化合物，該化合物由以下表示：具有式 (I-4) 之化合物



其中

A係CH或N、較佳的是N；

R₂係C₁-C₆鹵代烷基，較佳的是R₂係C₁-C₆氟烷基，更較佳的是R₂係-CH₂CF₂CF₃、-CH₂CF₂CHF₂、-CH₂CF₃、-CH₂CHF₂或-CH₂CF₂CHF₂CF₃；

R₃係氫或C₁-C₄烷基、較佳的是氫或甲基；

Q₁係氫、鹵素、C₁-C₆鹵代烷基、C₃-C₆環烷基、被氰基單取代的C₃-C₆環烷基、C₁-C₆氰基烷基、C₁-C₆鹵代烷氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、或-N(R₄)CON(R₄)₂、(嘔啞啞-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或

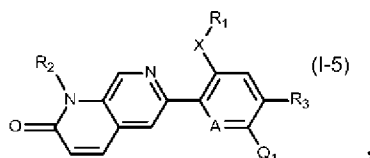
Q₁係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；或

Q₁係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統含有2或3個環氮原子；

R₄獨立地是氫或C₁-C₄烷基、較佳的是氫或甲基；並且

R₅係C₁-C₆烷基或C₃-C₆環烷基，較佳的是甲基、乙基或環丙基，更較佳的是甲基或環丙基。

【請求項6】如請求項1所述之具有式I之化合物，該化合物由以下表示：具有式 (I-5) 之化合物



其中A、X、R₁、和R₂係如請求項1中在式I下定義的，或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，並且其中，

Q₁係氫、鹵素、C₁-C₆鹵代烷基、C₃-C₆環烷基、被氰基單取代的C₃-C₆環烷基、

C₁-C₆氰基烷基、C₁-C₆鹵代烷氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、或-N(R₄)CON(R₄)₂、(嘔啞啉-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或

Q₁係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；或

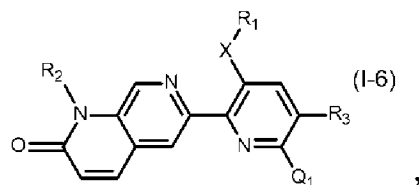
Q₁係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統含有2或3個環氮原子；

R₃係氫或C₁-C₄烷基；

每個R₄獨立地是氫或C₁-C₄烷基；並且

R₅係C₁-C₆烷基或C₃-C₆環烷基。

【請求項7】如請求項1所述之具有式I之化合物，該化合物由以下表示：具有式 (I-6) 之化合物



其中X、R₁和R₂係如請求項1中在式I下定義的，或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，並且其中，

Q₁係氫、鹵素、C₁-C₆鹵代烷基、C₃-C₆環烷基、被氰基單取代的C₃-C₆環烷基、C₁-C₆氰基烷基、C₁-C₆鹵代烷氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、或-N(R₄)CON(R₄)₂、(嘔啞啉-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或

Q₁係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；或

Q₁係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的

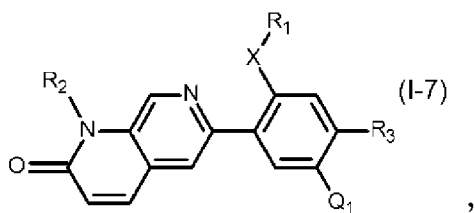
環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、
 氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統含有2或3個環氮原子；

R₃係氫或C₁-C₄烷基；

每個R₄獨立地是氫或C₁-C₄烷基；並且

R₅係C₁-C₆烷基或C₃-C₆環烷基。

【請求項8】如請求項1所述之具有式I之化合物，該化合物由以下表示：具有式 (I-7) 之化合物



其中X、R₁和R₂係如請求項1中在式I下定義的，或其農用化學上可接受的鹽、
 立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，並且其中，

Q₁係氫、鹵素、C₁-C₆鹵代烷基、C₃-C₆環烷基、被氰基單取代的C₃-C₆環烷基、
 C₁-C₆氰基烷基、C₁-C₆鹵代烷氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、或-N(R₄)CON(R₄)₂、
 (嗎唑啉-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或

Q₁係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由碳原子連接至含有取代基
 A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵
 素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；或

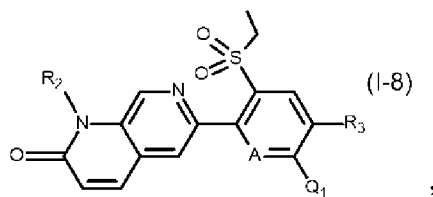
Q₁係五員芳香族環系統，所述環系統經由氮原子連接至含有取代基A的環，
 所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基
 和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統含有2或3個環氮原子；

R₃係氫或C₁-C₄烷基；

每個R₄獨立地是氫或C₁-C₄烷基；並且

R₅係C₁-C₆烷基或C₃-C₆環烷基。

【請求項9】如請求項1所述之具有式I之化合物，該化合物由以下表示：具有式 (I-8) 之化合物



其中

A係CH或N、較佳的是N；

R₂係C₁-C₆鹵代烷基，較佳的是R₂係C₁-C₆氟烷基，更較佳的是R₂係-CH₂CF₂CF₃、-CH₂CF₂CHF₂、-CH₂CF₃、-CH₂CHF₂或-CH₂CF₂CHF₂CF₃；

R₃係氫或C₁-C₄烷基、較佳的是氫或甲基；

Q₁係氫、鹵素、C₁-C₆鹵代烷基、C₃-C₆環烷基、被氰基單取代的C₃-C₆環烷基、C₁-C₆氰基烷基、C₁-C₆鹵代烷氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、或-N(R₄)CON(R₄)₂、(呋啞啉-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或

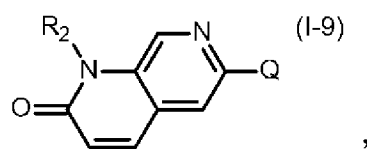
Q₁係五員至六員芳香族環系統，所述環系統經由環碳原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統可以含有1或2個環氮原子；或

Q₁係五員芳香族環系統，所述環系統經由環氮原子連接至含有取代基A的環，所述環系統係未取代的或被選自由以下組成之群組的取代基單取代：鹵素、氰基和C₁-C₄鹵代烷基；並且所述環系統含有2或3個環氮原子；

每個R₄獨立地是氫或C₁-C₄烷基、較佳的是氫或甲基；並且

R₅係C₁-C₆烷基或C₃-C₆環烷基；較佳的是甲基、乙基或環丙基，更較佳的是甲基或環丙基。

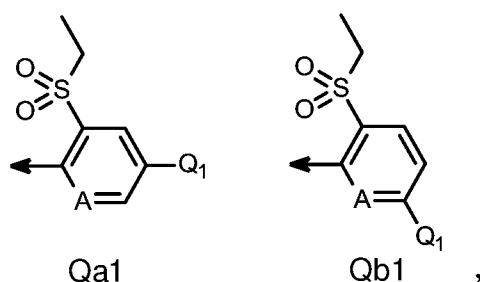
【請求項10】如請求項1所述之具有式I之化合物，該化合物由以下表示：具有式 (I-9) 之化合物



其中

R_2 係 C_1 - C_6 鹵代烷基，較佳的是 R_2 係 C_1 - C_6 氟烷基，更較佳的是 R_2 係 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHF_2CF_3$ ；

Q 係選自由以下組成之群組的基團：式 Qa1 和 Qb1



其中箭頭指示與雙環的碳原子的附接點；

並且其中

A 係 CH 或 N、較佳的是 N；並且

Q_1 係氫、鹵素、三氟甲基、環丙基、氰基環丙基、氰基異丙基、三氟乙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ ，在其中的每一個中， R_4 獨立地是氫或甲基並且 R_5 係甲基、乙基或環丙基；較佳的是 R_5 係甲基或環丙基，或

Q_1 係(吡啶啉-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、未取代的或被氯、氰基或三氟甲基單取代的 N-連接的吡啶基，或 Q_1 係 N-連接的三唑基或 C-連接的嘧啶基。

【請求項 11】如請求項 1 - 10 中任一項所述之化合物，其中， Q_1 係氫、氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHCOCH_3$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-NHCO$ (環丙基)、 $-N(CH_3)CO$ (環丙基)、 $-N(H)CONH_2$ 、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(H)CON(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)CONH_2$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CON(CH_3)_2$ 、(吡啶啉-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶

-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

【請求項12】如請求項1 - 10中任一項所述之化合物，其中， Q_1 係氫、氯、溴、三氟甲基、環丙基、1-氰基環丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N(CH₃)CO(環丙基)、-N(H)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CONH(CH₃)、(嘔啶-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

【請求項13】如請求項1 - 10中任一項所述之化合物，其中， R_2 係-CH₂CF₂CF₃、-CH₂CF₂CHF₂、-CH₂CF₃、-CH₂CHF₂或-CH₂CF₂CHF₂CF₃。

【請求項14】如請求項1所述之具有式I之化合物，該化合物選自由以下組成之群組：

6-(3-乙基氫硫基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啶-2-酮（化合物P1）；6-(3-乙基磺醯基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啶-2-酮（化合物P2）；1-[5-乙基磺醯基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啶-6-基]-3-吡啶基]環丙烷甲腈（化合物P3）；6-[3-乙基磺醯基-6-(1,2,4-三唑-1-基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啶-2-酮（化合物P4）；6-(6-環丙基-3-乙基磺醯基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啶-2-酮（化合物P5）；2-[5-乙基磺醯基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啶-6-基]-3-吡啶基]-2-甲基-丙腈（化合物P6）；N-[5-乙基磺醯基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啶-6-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙醯胺（化合物P7）；6-[5-(3-氯吡啶-1-基)-3-乙基磺醯基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啶-2-酮（化合物P8）；6-[3-乙基磺醯基-5-(2-吡啶基氧基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啶-2-酮（化合物P9）；1-[5-乙基磺醯基-6-[2-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-噻啶-6-基]-3-吡啶基]環丙烷甲腈（化合物P10）；6-[3-乙基磺醯基-6-(三唑-2-基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噻啶-2-酮（化合物P11）；6-[3-乙基磺醯基-6-(三唑-1-基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙

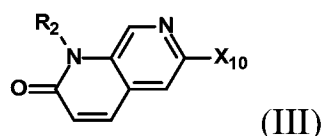
基)-1,7-噁啉-2-酮(化合物P12);1-[5-乙基氫硫基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噁啉-6-基]-3-吡啶基]環丙烷甲腈(化合物P13);6-[5-(3-氯吡啶-1-基)-3-乙基氫硫基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噁啉-2-酮(化合物P14);1-[5-乙基氫硫基-6-[2-側氧基-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-噁啉-6-基]-3-吡啶基]環丙烷甲腈(化合物P15);6-[3-乙基氫硫基-5-(2-吡啶基氧基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噁啉-2-酮(化合物P16);以及2-[5-乙基氫硫基-6-[2-側氧基-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-噁啉-6-基]-3-吡啶基]-2-甲基-丙腈(化合物P17)。

【請求項15】一種組成物，其包含殺昆蟲、殺蟎、殺線蟲、或殺軟體動物有效量的如請求項1-14中任一項定義的具有式(I)之化合物，或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，以及視需要，助劑或稀釋劑。

【請求項16】一種對抗並控制昆蟲、蟎、線蟲或軟體動物之方法，該方法包括向有害生物、有害生物的場所、或易受有害生物攻擊的植物施用殺昆蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物有效量的如請求項1-14中任一項定義的具有式(I)之化合物，或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，或如請求項15定義的組成物。

【請求項17】一種用於保護植物繁殖材料免受昆蟲、蟎、線蟲或軟體動物攻擊之方法，該方法包括用如請求項15所述之組成物處理該繁殖材料或該繁殖材料所種植的場地。

【請求項18】一種具有式III的化合物，

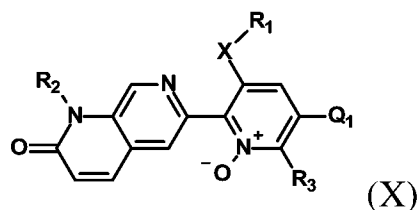


其中

R₂係如上在式I下定義的；並且

X₁₀係鹵素或擬鹵素脫離基。

【請求項19】一種具有式X的化合物，

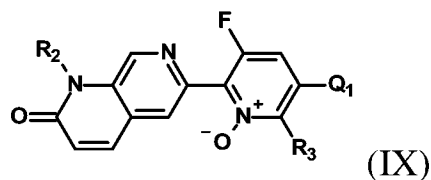


其中

X係S；並且

R₂、Q₁、R₃和R₁係如在請求項1中在式I下定義的。

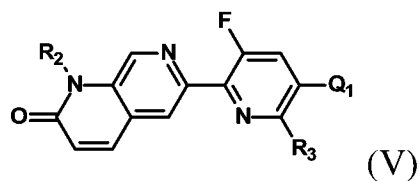
【請求項20】一種具有式IX的化合物，



其中

R₂、Q₁和R₃係如在請求項1中在式I下定義的。

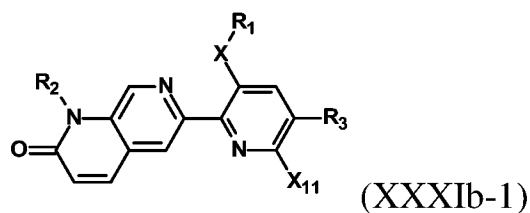
【請求項21】一種具有式V的化合物，



其中

R₂、Q₁和R₃係如在請求項1中在式I下定義的。

【請求項22】一種具有式XXXIb-1的化合物，



其中

X係S、SO或SO₂；

X_{11} 係鹵素或擬鹵素脫離基；並且

R_1 、 R_2 和 R_3 係如在請求項1中在式I下定義的。