



# (12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 110730779 B

(45) 授权公告日 2023.05.02

(21) 申请号 201880033917.8

(22) 申请日 2018.04.26

(65) 同一申请的已公布的文献号  
申请公布号 CN 110730779 A

(43) 申请公布日 2020.01.24

(30) 优先权数据  
201711015515 2017.05.02 IN

(85) PCT国际申请进入国家阶段日  
2019.11.22

(86) PCT国际申请的申请数据  
PCT/EP2018/060725 2018.04.26

(87) PCT国际申请的公布数据  
W02018/202540 EN 2018.11.08

(73) 专利权人 先正达参股股份有限公司  
地址 瑞士巴塞尔

(72) 发明人 M·米尔巴赫 A·埃德蒙兹  
S·伦德勒 V·斯科瓦尔  
G·拉瓦尔 I·森

(74) 专利代理机构 中国贸促会专利商标事务所  
有限公司 11038

专利代理师 张敏

(51) Int.Cl.  
C07D 401/04 (2006.01)  
C07D 235/16 (2006.01)  
C07D 471/04 (2006.01)  
C07D 471/06 (2006.01)  
C07D 487/04 (2006.01)  
C07D 487/06 (2006.01)  
A01P 17/00 (2006.01)  
A01N 43/90 (2006.01)

(56) 对比文件  
CN 103717598 A, 2014.04.09  
CN 104968663 A, 2015.10.07  
CN 106414441 A, 2017.02.15  
CN 107428759 A, 2017.12.01  
CN 107428764 A, 2017.12.01  
TW 201311149 A, 2013.03.16  
WO 2014053401 A2, 2014.04.10

审查员 耿佳琳

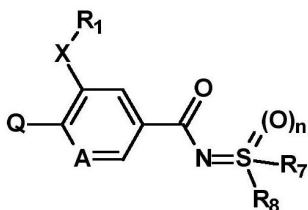
权利要求书4页 说明书90页

## (54) 发明名称

具有含硫取代基的杀有害生物活性杂环衍生物

## (57) 摘要

具有式I的化合物



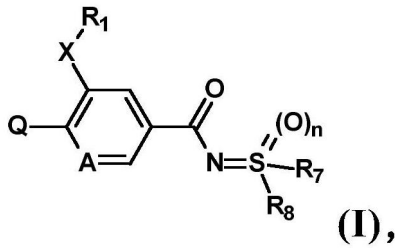
其中取代基是如

(I),

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

CN 110730779 B

1. 一种具有式I的化合物



其中

A是CH或N;

X是S、SO或SO<sub>2</sub>;

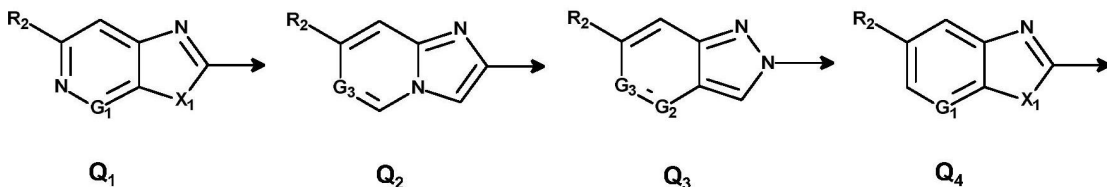
R<sub>1</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基;

R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>彼此独立地是甲基、乙基、正丙基或异丙基;或者

R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>与它们所附接的硫原子一起形成没有氧原子的四元饱和环系统或包含一个氧原子的六元饱和环系统;

n是0或1;

Q是选自由以下组成的组的基团: 式Q<sub>1</sub>至Q<sub>4</sub>



其中箭头指示与含有基团A的环的附接点;

并且其中

X<sub>1</sub>是NR<sub>3</sub>, 其中R<sub>3</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基;

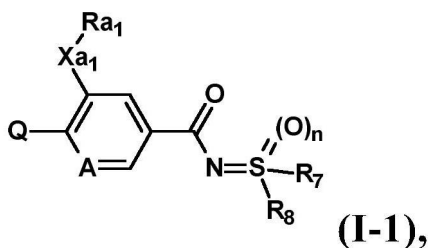
R<sub>2</sub>是卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基磺酰基或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基;

G<sub>1</sub>是N;

G<sub>2</sub>和G<sub>3</sub>彼此独立地是N或CH; 或

式I的化合物的农用化学上可接受的盐。

2. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物, 所述化合物由具有式I-1的化合物表示

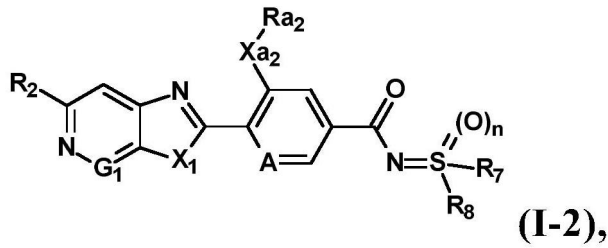


其中Q、A、n、R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>是如权利要求1中在式I下所定义的;

Xa<sub>1</sub>是S、SO或SO<sub>2</sub>; 并且

Ra<sub>1</sub>是甲基、乙基、正丙基、异丙基或环丙基甲基。

3. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物, 所述化合物由具有式I-2的化合物表示

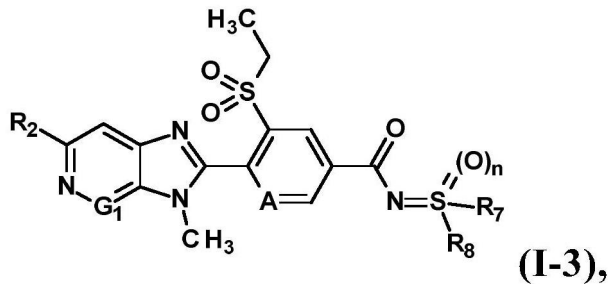


其中 $X_1$ 、 $R_2$ 、 $G_1$ 、 $A$ 、 $n$ 、 $R_7$ 和 $R_8$ 是如权利要求1中在式I下所定义的；

$X_{a2}$ 是S、SO或 $SO_2$ ；并且

$R_{a2}$ 是甲基、乙基、正丙基、异丙基或环丙基甲基。

4. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物，所述化合物由具有式I-3的化合物表示



其中

A是N；

$R_2$ 是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基；

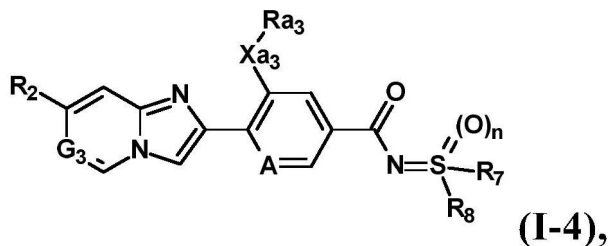
$G_1$ 是N；

$n$ 是0或1；

$R_7$ 和 $R_8$ 彼此独立地是甲基、乙基、正丙基或异丙基；或者

$R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成六元饱和环系统，所述环系统可以含有一个氧原子。

5. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物，所述化合物由具有式I-4的化合物表示

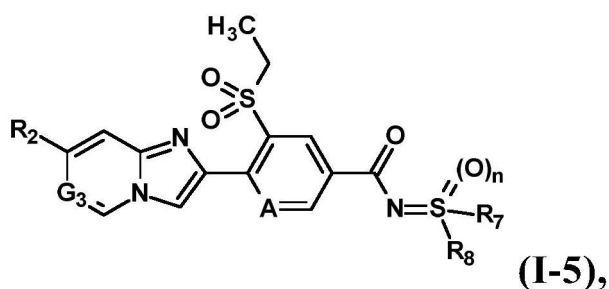


其中 $R_2$ 、 $G_3$ 、 $A$ 、 $n$ 、 $R_7$ 和 $R_8$ 是如权利要求1中在式I下所定义的；

$X_{a3}$ 是S、SO或 $SO_2$ ；并且

$R_{a3}$ 是甲基、乙基、正丙基、异丙基或环丙基甲基。

6. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物，所述化合物由具有式I-5的化合物表示



其中

A是CH或N;

R<sub>2</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基;

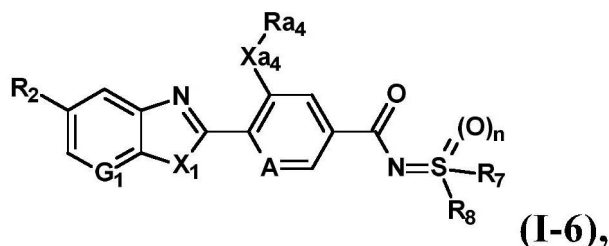
G<sub>3</sub>是N或CH;

n是0或1;并且

R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>彼此独立地是甲基、乙基、正丙基或异丙基;或者

R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>与它们所附接的硫原子一起形成六元饱和环系统,所述环系统可以包含一个氧原子。

7. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物,所述化合物由具有式I-6的化合物表示

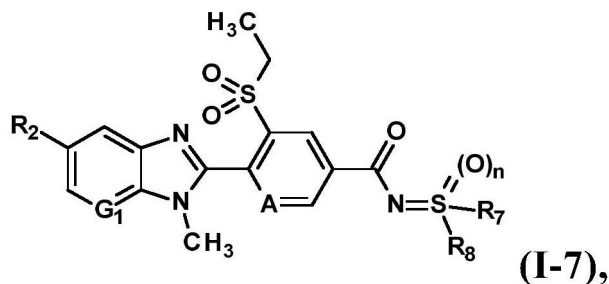


其中X<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、G<sub>1</sub>、A、n、R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>是如权利要求1中在式I下所定义的;

Xa<sub>4</sub>是S、SO或SO<sub>2</sub>;并且

Ra<sub>4</sub>是甲基、乙基、正丙基、异丙基或环丙基甲基。

8. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物,所述化合物由具有式I-7的化合物表示



其中

A是N;

R<sub>2</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基;

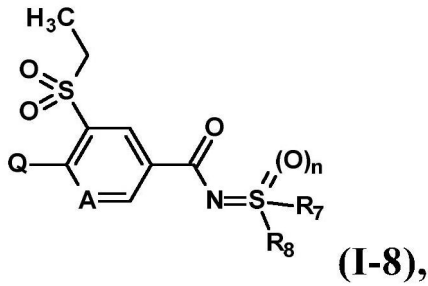
G<sub>1</sub>是N;

n是0或1;并且

R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>彼此独立地是甲基、乙基、正丙基或异丙基;或者

R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>与它们所附接的硫原子一起形成六元饱和环系统,所述环系统可以包含一个氧原子。

9. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物,所述化合物由具有式I-8的化合物表示:



其中

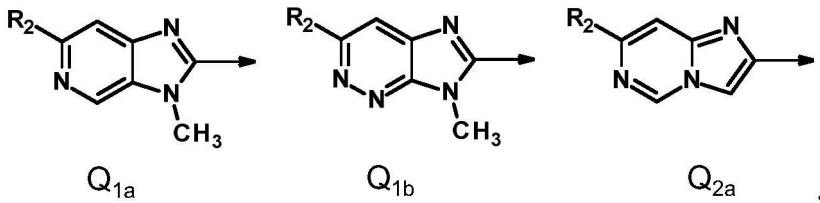
A是CH或N;

n是0或1;

R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>彼此独立地是甲基、乙基、正丙基或异丙基;或者

R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>与它们所附接的硫原子一起形成六元饱和环系统,所述环系统可以含有一个氧原子;并且

Q是选自由以下组成的组的基团:式Q1a、Q1b和Q2a



其中箭头指示与含有基团A的环的附接点;

并且其中

R<sub>2</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基。

10. 一种杀有害生物组合物,所述杀有害生物组合物包含:作为活性成分的至少一种根据权利要求1所述的具有式I的化合物,在每种情况下呈游离形式或农用化学上可用的盐形式;以及至少一种助剂。

11. 一种用于控制有害生物的方法,所述方法包括将根据权利要求10所述的组合物施用于这些有害生物或其环境,除了通过手术或疗法用于治疗人或动物体的方法以及在人或动物体上实施的诊断方法之外。

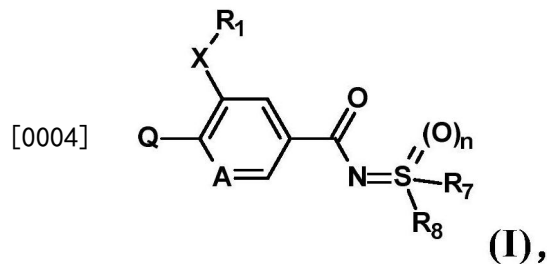
12. 一种用于保护植物繁殖材料免受有害生物攻击的方法,所述方法包括用根据权利要求10所述的组合物处理所述繁殖材料或所述繁殖材料所种植的场所。

## 具有含硫取代基的杀有害生物活性杂环衍生物

[0001] 本发明涉及包含硫取代基的杀有害生物活性(特别是杀昆虫活性)杂环衍生物、涉及其制备方法、涉及包含那些化合物的组合物、并且涉及它们用于控制动物有害生物(包括节肢动物并且特别是昆虫或蜚蠊目的代表)的用途。

[0002] 具有杀有害生物作用的杂环化合物是已知的并描述于例如W0 2014/123206、W0 2014/132972和W0 2015/121136。现已发现具有含硫苯基和吡啶基取代基的新型杀有害生物活性杂环酰基硫亚胺和亚砷亚胺衍生物。

[0003] 本发明因此涉及具有式I的化合物，



[0005] 其中

[0006] A是CH或N;

[0007] X是S、SO或SO<sub>2</sub>;

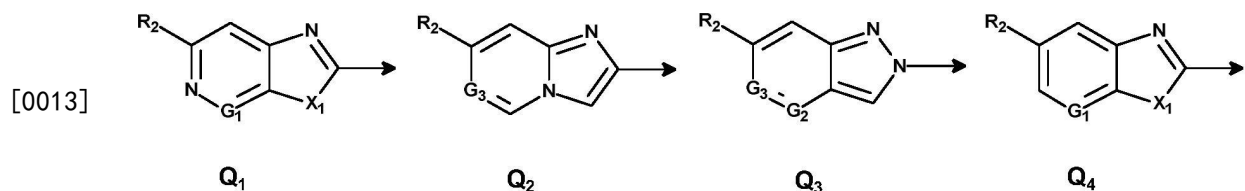
[0008] R<sub>1</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基;

[0009] R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>彼此独立地是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>氰基烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、吡啶基或苯基,其中所述吡啶基或苯基可以被选自由以下组成的组的取代基单取代或多取代:卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基硫烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基磺酰基和-C(O)C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基;或者

[0010] R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>与它们所连的硫原子一起形成四至六元饱和环系统,所述环系统可以被选自由以下组成的组的取代基单取代或多取代:卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基和C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基;并且所述环系统可以包含一个选自由以下组成的组的杂原子:氮、硫和氧;

[0011] n是0或1;

[0012] Q是选自由以下组成的组的基团:式Q<sub>1</sub>至Q<sub>4</sub>



[0014] 其中箭头指示与掺入了基团A的环的附接点;

[0015] 并且其中

[0016] X<sub>1</sub>是O、S或NR<sub>3</sub>,其中R<sub>3</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基;

[0017] R<sub>2</sub>是卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基硫烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基磺酰基或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基;

[0018]  $G_1$ 是N或CH;

[0019]  $G_2$ 和 $G_3$ 彼此独立地是N或CH;并且

[0020] 所述具有式I的化合物的农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体和N-氧化物。

[0021] 具有至少一个碱性中心的具有式I的化合物可以例如与以下形成例如酸加成盐:强无机酸(例如矿物酸,例如高氯酸、硫酸、硝酸、硝酸类酸(nitrose acid)、磷酸或氢卤酸),强有机羧酸(例如未取代的或例如被卤素取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷羧酸,例如乙酸,例如饱和或不饱和的二羧酸,例如草酸、丙二酸、琥珀酸、马来酸、富马酸或邻苯二甲酸,例如羟基羧酸,例如抗坏血酸、乳酸、苹果酸、酒石酸或柠檬酸,或例如苯甲酸),或有机磺酸(例如未取代的或例如被卤素取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷磺酸或芳基磺酸,例如甲烷磺酸或对甲苯磺酸)。具有至少一个酸性基团的具有式I的化合物可以例如与碱形成盐,例如矿物盐,例如碱金属或碱土金属盐,例如钠盐、钾盐或镁盐;或与氨或有机胺(例如吗啉,哌啶,吡咯烷,单、二或三低级烷基胺,例如乙胺、二乙胺、三乙胺或二甲基丙基胺,或单、二或三羟基低级烷基胺,例如单乙醇胺、二乙醇胺或三乙醇胺)形成盐。

[0022] 在取代基定义中出现的烷基可以是直链的或支链的,并且是例如甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、戊基、己基、壬基、癸基以及它们的支链异构体。烷基硫烷基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷氧基、烯基和炔基基团衍生自所提及的烷基基团。烯基和炔基可以是单不饱和的或多不饱和的。

[0023] 卤素通常是氟、氯、溴或碘。相应地,这也适用于与其他含义结合的卤素,例如卤代烷基或卤代苯基。

[0024] 卤代烷基优选地具有从1至6个碳原子的链长。卤代烷基是例如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、2,2,2-三氟乙基、2-氟乙基、2-氯乙基、五氟乙基、1,1-二氟-2,2,2-三氯乙基、2,2,3,3-四氟乙基和2,2,2-三氯乙基;优选地是三氯甲基、二氟氯甲基、二氟甲基、三氟甲基和二氯氟甲基。

[0025] 烷氧基优选地具有从1至6个碳原子的优选的链长。烷氧基是例如甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基和叔丁氧基并且还是同分异构的戊氧基和己氧基基团;优选地是甲氧基和乙氧基。

[0026] 烷氧基烷基基团优选地具有1至6个碳原子的链长,更优选地1至4个碳原子的链长。烷氧基烷基是例如甲氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基甲基、乙氧基乙基、正丙氧基甲基、正丙氧基乙基、异丙氧基甲基或异丙氧基乙基。

[0027] 烷基硫烷基是例如甲基硫烷基、乙基硫烷基、丙基硫烷基、异丙基硫烷基、丁基硫烷基、戊基硫烷基、以及己基硫烷基。

[0028] 烷基亚磺酰基是例如甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、丙基亚磺酰基、异丙基亚磺酰基、丁基亚磺酰基、戊基亚磺酰基和己基亚磺酰基。

[0029] 烷基磺酰基是例如甲基磺酰基、乙基磺酰基、丙基磺酰基、异丙基磺酰基、丁基磺酰基、戊基磺酰基和己基磺酰基。

[0030] 环烷基优选地具有从3至6个环碳原子,例如环丙基、环丁基、环戊基和环己基。

[0031] 卤代烷氧基基团优选具有从1至4个碳原子的链长。卤代烷氧基是例如二氟甲氧基、三氟甲氧基或2,2,2-三氟乙氧基。

[0032] 卤代烷基硫烷基基团优选地具有从1至4个碳原子的链长。卤代烷基硫烷基是例如二氟甲基硫烷基、三氟甲基硫烷基或2,2,2-三氟乙基硫烷基。类似的考虑适用于基团 $C_1-C_4$ 卤代烷基亚磺酰基和 $C_1-C_4$ 卤代烷基磺酰基,它们可以是例如三氟甲基亚磺酰基、三氟甲基磺酰基或2,2,2-三氟乙基磺酰基。

[0033] 在本发明的上下文中,取代基定义中的“单到多取代的”典型地意指,取决于取代基的化学结构,单取代的到四次取代的,优选是单取代的到三次取代的,更优选是单或二取代的。

[0034] 自由基表示甲基。

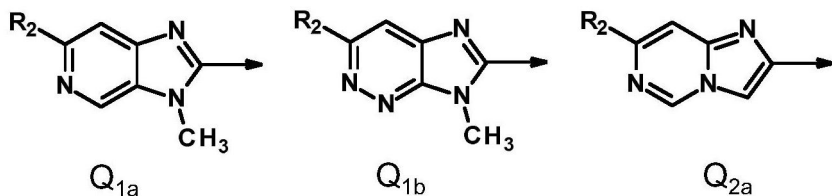
[0035] 根据本发明的具有式I的化合物还包括在盐形成期间可能形成的水合物。

[0036]  $X_1$ 、 $Q$ 、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $X$ 、 $A$ 和 $n$ 的优选值以其任何组合如下所示:

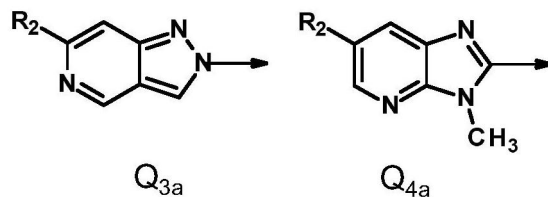
[0037] 优选地, $X_1$ 是 $NR_3$ ,其中 $R_3$ 是 $C_1-C_4$ 烷基。

[0038] 最优选地 $X_1$ 是 $NCH_3$ 。

[0039] 优选地, $Q$ 是选自自由以下组成的组的基团:式 $Q_{1a}$ 、 $Q_{1b}$ 、 $Q_{2a}$ 、 $Q_{3a}$ 和 $Q_{4a}$



[0040]



其中箭头指示与掺入了基团A的环的附接点。

[0041] 最优选地 $Q$ 是基团 $Q_{1a}$ 、 $Q_{1b}$ 或 $Q_{2a}$ 。

[0042] 优选地, $R_1$ 是 $C_1-C_4$ 烷基或 $C_3-C_6$ 环烷基- $C_1-C_4$ 烷基。

[0043] 更优选地, $R_1$ 是 $C_1-C_4$ 烷基或环丙基甲基。

[0044] 甚至更优选地, $R_1$ 是甲基、乙基、正丙基、异丙基或环丙基甲基。

[0045] 最优选地 $R_1$ 是乙基。

[0046] 优选地, $R_2$ 是卤素、 $C_1-C_4$ 卤代烷基、 $C_1-C_4$ 卤代烷基硫烷基、 $C_1-C_4$ 卤代烷基亚磺酰基或 $C_1-C_4$ 卤代烷基磺酰基。

[0047] 更优选地, $R_2$ 是卤素或 $C_1-C_3$ 卤代烷基。

[0048] 甚至更优选地, $R_2$ 是 $C_1-C_2$ 卤代烷基。

[0049] 最优选地 $R_2$ 是三氟甲基。

[0050] 优选地, $R_7$ 和 $R_8$ 各自独立地是 $C_1-C_6$ 烷基;或 $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成四至六元饱和环系统,所述环系统可以含有一个氧原子。

[0051] 更优选地, $R_7$ 和 $R_8$ 各自独立地是 $C_1-C_4$ 烷基;或 $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成没有氧原子的四元或五元饱和环系统,或形成可以包含一个氧原子的六元饱和环系统。

[0052] 甚至更优选地, $R_7$ 和 $R_8$ 各自独立地是甲基、乙基、正丙基或异丙基;或 $R_7$ 和 $R_8$ 与它们



所附接的硫原子一起形成没有氧原子的四元饱和环系统,或形成包含一个氧原子的六元饱和环系统(最优选地是所述六元饱和环系统是 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ )。

[0053] 最优选地, $R_7$ 是甲基,并且 $R_8$ 是乙基;或 $R_7$ 和 $R_8$ 均是甲基;或 $R_7$ 和 $R_8$ 均是乙基。

[0054] 优选地X是S或 $\text{SO}_2$ 。

[0055] 最优选地X是 $\text{SO}_2$ 。

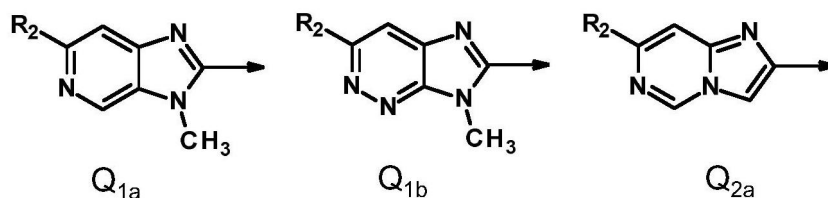
[0056] 优选地,A是N。

[0057] 优选地n是1。

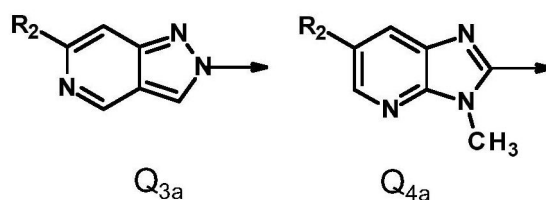
[0058] 如下所述,提供了根据本发明的实施例。

[0059] 实施例1提供了如上所定义的具有式I的化合物或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物。

[0060] 实施例2提供根据实施例1所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中Q是选自由式 $Q_{1a}$ 、 $Q_{1b}$ 、 $Q_{2a}$ 、 $Q_{3a}$ 和 $Q_{4a}$ 组成的组的基团



[0061]



其中箭头指示与掺入了基团A的环的附接点。

[0062] 实施例3提供根据实施例1或2所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中 $R_1$ 是 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基或 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 环烷基- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基。

[0063] 实施例4提供根据实施例1、2或3中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中 $R_2$ 是卤素、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 卤代烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 卤代烷基硫烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 卤代烷基亚磺酰基或 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 卤代烷基磺酰基。

[0064] 实施例5提供根据实施例1、2、3或4中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中 $R_7$ 和 $R_8$ 各自独立地是 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ 烷基;或 $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成四至六元饱和环系统,所述环系统可以含有一个氧原子。

[0065] 实施例6提供根据实施例1、2、3、4、或5中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中X是S或 $\text{SO}_2$ 。

[0066] 实施例7提供根据实施例1、2、3、4、5、或6中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中 $R_1$ 是 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基或环丙基甲基。

[0067] 实施例8提供根据实施例1、2、3、4、5、6、或7中任一项所述的化合物、或其农业化学

上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中 $R_2$ 是卤素或 $C_1-C_3$ 卤代烷基。

[0068] 实施例9提供根据实施例1、2、3、4、5、6、7、或8中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中 $R_7$ 和 $R_8$ 各自独立地是 $C_1-C_4$ 烷基;或 $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成没有氧原子的四元或五元饱和环系统,或形成可以包含一个氧原子的六元饱和环系统。

[0069] 实施例10提供根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、或9中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中X是 $SO_2$ 。

[0070] 实施例11提供根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9或10中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中 $R_1$ 是甲基、乙基、正丙基、异丙基或环丙基甲基。

[0071] 实施例12提供根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10或11中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中 $R_2$ 是 $C_1-C_2$ 卤代烷基。

[0072] 实施例13提供根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11或12中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中 $R_7$ 和 $R_8$ 各自独立地是甲基、乙基、正丙基或异丙基;或 $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成没有氧原子的四元饱和环系统,或形成包含一个氧原子的六元饱和环系统(最优选地是所述六元饱和环系统是 $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$ )。

[0073] 实施例14提供根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12或13中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中 $R_1$ 是乙基。

[0074] 实施例15提供根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13或14中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中 $R_2$ 是三氟甲基。

[0075] 实施例16提供根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14或15中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中 $R_7$ 是甲基,并且 $R_8$ 是乙基;或 $R_7$ 和 $R_8$ 均是甲基;或 $R_7$ 和 $R_8$ 均是乙基。

[0076] 实施例17提供根据实施例2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15或16中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中Q是基团 $Q_{1a}$ 。

[0077] 实施例18提供根据实施例2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15或16中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中Q是基团 $Q_{1b}$ 。

[0078] 实施例19提供根据实施例2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15或16中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中Q是基团 $Q_{2a}$ 。

[0079] 实施例20提供根据实施例2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15或16中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化

物,其中Q是基团 $Q_{3a}$ 。

[0080] 实施例21提供根据实施例2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15或16中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中Q是基团 $Q_{4a}$ 。

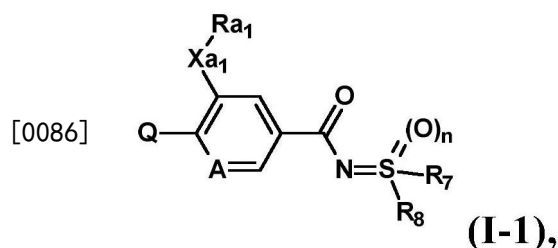
[0081] 实施例22提供了根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20或21中任一项所述的化合物或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中A是N。

[0082] 实施例23提供了根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20或21中任一项所述的化合物或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中A是CH。

[0083] 实施例24提供根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22或23中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中n是0。

[0084] 实施例25提供根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22或23中任一项所述的化合物、或其农业化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中n是1。

[0085] 具有式I的化合物的优选的组由具有式I-1的化合物表示



[0087] 其中Q、A、n、 $R_7$ 和 $R_8$ 是如上文在式I下所定义的;并且其中 $Xa_1$ 是S、SO或 $SO_2$ ;  $Ra_1$ 是甲基、乙基、正丙基、异丙基或环丙基甲基。

[0088] 在具有式I-1的化合物的所述优选的组中,A优选地是N, $Xa_1$ 优选地是S或 $SO_2$ ,更优选地是 $SO_2$ ,并且 $Ra_1$ 优选地是乙基。在具有式I-1的化合物的另一个优选的组中,A优选地是CH, $Xa_1$ 优选地是S或 $SO_2$ ,更优选地是 $SO_2$ ,并且 $Ra_1$ 优选地是乙基。

[0089] 在具有式I-1的化合物的另一个优选组中,n是0或1,优选n是1,并且 $R_7$ 和 $R_8$ 彼此独立地是 $C_1$ - $C_6$ 烷基,甚至更优选是甲基或乙基。

[0090] 在具有式I-1的化合物的另一个优选组中,n是0或1,优选n是1,并且 $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成四元至六元的饱和环系统,所述环系统可以包含一个氧原子;优选地,所述环系统是未取代的,并且所述环系统不包含氧原子或包含一个氧原子。

[0091] 具有式I-1的化合物的所述特别优选的组的另一个优选实施例包含其中A是N或CH的化合物; $Xa_1$ 优选地是 $SO_2$ ;  $Ra_1$ 优选地是乙基;n是0或1;并且 $R_7$ 和 $R_8$ 彼此独立地是 $C_1$ - $C_6$ 烷基,甚至更优选是甲基或乙基;或 $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成六元饱和环系统,所述环系统可以包含一个氧原子;优选地,所述环系统是未取代的,并且所述环系统包含一个氧原子;

[0092] 或 $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成四元饱和环系统,所述环系统可以包含一个氧原子;优选地,所述环系统是未取代的,并且所述环系统不含氧原子。

[0093] 在具有式I-1的化合物和上述具有式I-1的化合物的所有优选实施例中, Q优选选自 $Q_1$ 和 $Q_2$ , 其中 $X_1$ 、 $R_2$ 、 $G_1$ 和 $G_3$ 如以上式I下所定义。在具有式I-1的化合物的所述尤其优选的组中,  $X_1$ 优选地是 $NR_3$ , 其中 $R_3$ 是 $C_1$ - $C_4$ 烷基, 更优选地是甲基;  $R_2$ 优选地是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基, 更优选地是三氟甲基;  $G_1$ 是CH或N; 并且 $G_3$ 优选是N。

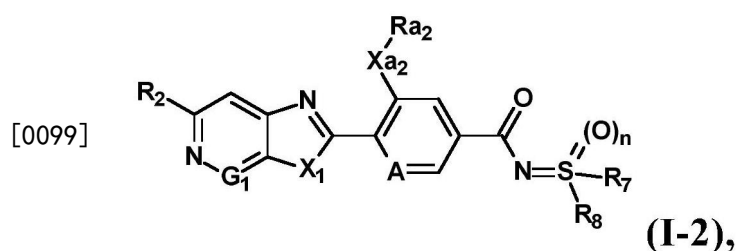
[0094] 在具有式I-1的化合物的另一优选实施例和上述具有式I-1的化合物的所有优选实施例中, Q优选选自 $Q_1$ - $Q_4$ , 其中 $X_1$ 、 $R_2$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 和 $G_3$ 如以上式I下所定义。在具有式I-1的化合物的所述尤其优选的组中,  $X_1$ 优选地是 $NR_3$ , 其中 $R_3$ 是 $C_1$ - $C_4$ 烷基, 更优选地是甲基;  $R_2$ 优选地是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基, 更优选地是三氟甲基;

[0095]  $G_1$ 是CH或N, 更优选地当Q是 $Q_1$ 时 $G_1$ 是CH或N并且当Q是 $Q_4$ 时 $G_1$ 是N;

[0096]  $G_2$ 优选是CH; 并且

[0097]  $G_3$ 优选是N。

[0098] 具有式I的化合物的另一个优选组由具有式I-2的化合物表示



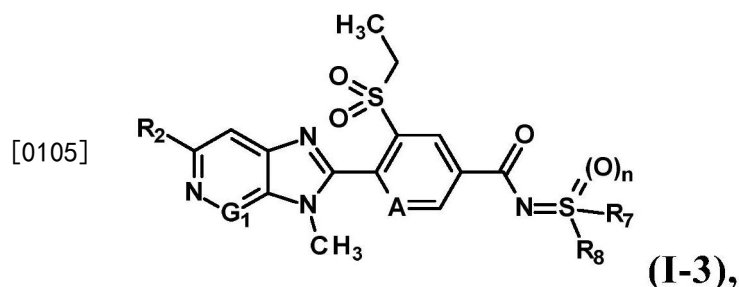
[0100] 其中 $X_1$ 、 $R_2$ 、 $G_1$ 、 $A$ 、 $n$ 、 $R_7$ 和 $R_8$ 是如上式I下所定义的; 并且其中 $Xa_2$ 是S、SO或 $SO_2$ ;  $Ra_2$ 是甲基、乙基、正丙基、异丙基或环丙基甲基。

[0101] 在具有式I-2的化合物的所述优选的组中,  $A$ 优选是N;  $Xa_2$ 优选地是S或 $SO_2$ , 更优选地是 $SO_2$ ; 并且 $Ra_2$ 优选地是乙基。在具有式I-2的化合物的进一步优选的组中,  $A$ 优选地是CH;  $Xa_2$ 优选地是S或 $SO_2$ , 更优选地是 $SO_2$ ; 并且 $Ra_2$ 优选地是乙基。

[0102] 在具有式I-2的化合物的另一个优选的组中,  $X_1$ 优选地是 $NR_3$ , 其中 $R_3$ 是 $C_1$ - $C_4$ 烷基, 更优选地是甲基;  $R_2$ 优选地是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基, 更优选地是三氟甲基; 并且 $G_1$ 是CH或N。

[0103] 在具有式I-2的化合物和上述具有式I-2的化合物的所有优选实施例中,  $n$ 是0或1, 更优选地 $n$ 是1; 并且 $R_7$ 和 $R_8$ 是如上式I下所定义的。具有式I-2的化合物的所述尤其优选的组的另一个优选的实施例包括其中的 $R_7$ 和 $R_8$ 彼此独立地是 $C_1$ - $C_6$ 烷基, 甚至更优选地是甲基或乙基的化合物; 或 $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成四至六元饱和环系统, 所述环系统可以包含一个氧原子; 优选地, 所述环系统是未取代的, 并且所述环系统不包含氧原子或包含一个氧原子; 或更优选地,  $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成不包含氧原子的四元的饱和的并且未取代的环系统或形成包含一个氧原子的六元的饱和的并且未取代的环系统。

[0104] 具有式I的化合物的另一个优选组由具有式I-3的化合物表示



[0106] 其中

[0107] A是N;

[0108]  $R_2$ 是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、优选地三氟甲基;

[0109]  $G_1$ 是N或CH;

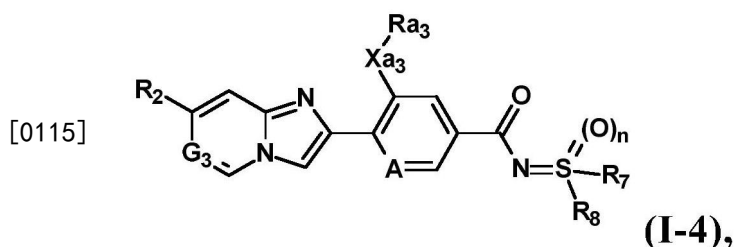
[0110] n是0或1, 优选n是1;

[0111]  $R_7$ 和 $R_8$ 彼此独立地是 $C_1$ - $C_6$ 烷基, 优选地是甲基或乙基; 或者

[0112]  $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成六元饱和环系统, 所述环系统可以包含一个氧原子; 优选地, 所述环系统是未取代的, 并且所述环系统包含一个氧原子; 或者

[0113]  $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成四元饱和环系统, 所述环系统不包含氧原子; 优选地, 所述环系统是未取代的。

[0114] 具有式I的化合物的另一个优选组由具有式I-4的化合物表示

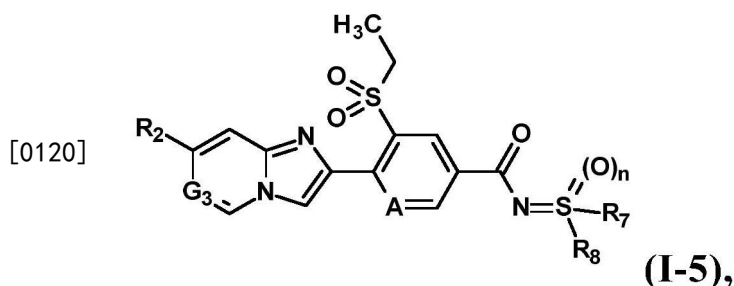


[0116] 其中 $R_2$ 、 $G_3$ 、A、n、 $R_7$ 和 $R_8$ 是如上式I下所定义的; 并且其中 $X_{a3}$ 是S、SO或 $SO_2$ ;  $R_{a3}$ 是甲基、乙基、正丙基、异丙基或环丙基甲基。

[0117] 在具有式I-4的化合物的所述优选的组中, A是CH或N;  $X_{a3}$ 优选地是S或 $SO_2$ , 更优选地是 $SO_2$ ; 并且 $R_{a3}$ 优选地是乙基。在具有式I-4的化合物的另一个优选的组中,  $R_2$ 优选地是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基, 更优选地是三氟甲基; 并且 $G_3$ 是CH或N, 优选地是N。

[0118] 在具有式I-4的化合物和上述具有式I-4的化合物的所有优选实施例中, n是0或1, 更优选地n是1; 并且 $R_7$ 和 $R_8$ 是如上式I下所定义的。具有式I-4的化合物的所述尤其优选的组的另一个优选的实施例包括其中的 $R_7$ 和 $R_8$ 彼此独立地是 $C_1$ - $C_6$ 烷基, 甚至更优选地是甲基或乙基的化合物; 或 $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成四至六元饱和环系统, 所述环系统可以包含一个氧原子; 优选地, 所述环系统是未取代的, 并且所述环系统不包含氧原子或包含一个氧原子; 或更优选地,  $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成不含有氧原子的四元的饱和的并且未取代的环系统。

[0119] 具有式I的化合物的另一个优选组由具有式I-5的化合物表示



[0121] 其中

[0122] A是CH或N;

[0123]  $R_2$ 是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、优选地三氟甲基;

[0124]  $G_3$ 是N或CH, 优选地是N;

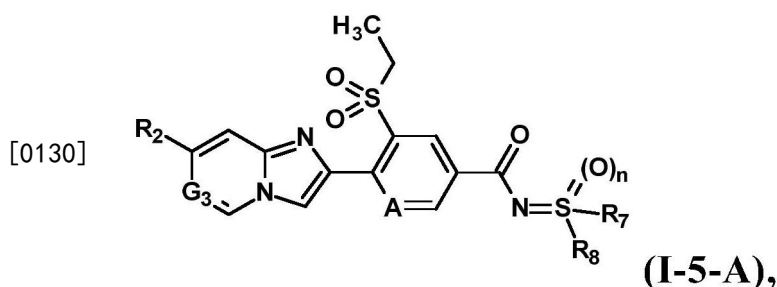
[0125]  $n$ 是0或1, 优选 $n$ 是1;

[0126]  $R_7$ 和 $R_8$ 彼此独立地是 $C_1$ - $C_6$ 烷基, 优选地是甲基或乙基; 或者

[0127]  $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成六元饱和环系统, 所述环系统可以含有一个氧原子; 优选地, 所述环系统是未取代的, 并且所述环系统包含一个氧原子; 或者

[0128]  $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成四元饱和环系统, 所述环系统不包含氧原子; 优选地, 所述环系统是未取代的。

[0129] 具有式I的化合物的另一个优选组由具有式I-5-A的化合物表示



[0131] 其中

[0132] A是CH或N;

[0133]  $R_2$ 是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基, 优选地三氟甲基;

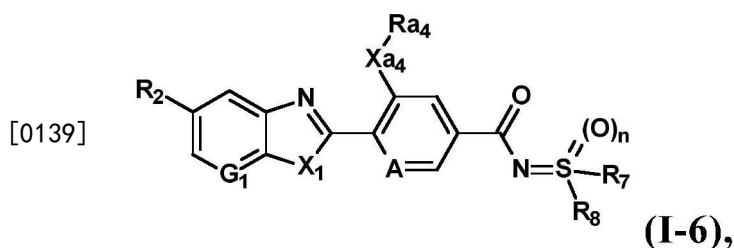
[0134]  $G_3$ 是N;

[0135]  $n$ 是0或1, 优选 $n$ 是1;

[0136]  $R_7$ 和 $R_8$ 彼此独立地是 $C_1$ - $C_6$ 烷基, 优选地是甲基或乙基; 或者

[0137]  $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成四元饱和环系统, 所述环系统不包含氧原子; 优选地, 所述环系统是未取代的。

[0138] 具有式I的化合物的另一个优选组由具有式I-6的化合物表示



[0140] 其中 $X_1$ 、 $R_2$ 、 $G_1$ 、A、 $n$ 、 $R_7$ 和 $R_8$ 是如上式I下所定义的; 并且其中 $X_{a4}$ 是S、SO或 $SO_2$ ;  $R_{a4}$ 是甲基、乙基、正丙基、异丙基或环丙基甲基。

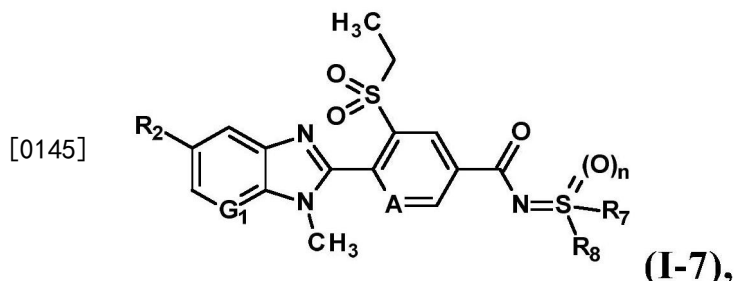
[0141] 在具有式I-6的化合物的所述优选的组中, A优选是N;  $X_{a4}$ 优选地是S或 $SO_2$ , 更优选地是 $SO_2$ ; 并且 $R_{a4}$ 优选地是乙基。在具有式I-6的化合物的另一个优选的组中, A优选是CH;  $X_{a4}$ 优选地是S或 $SO_2$ , 更优选地是 $SO_2$ ; 并且 $R_{a4}$ 优选地是乙基。

[0142] 在具有式I-6的化合物的另一个优选的组中,  $X_1$ 优选地是 $NR_3$ , 其中 $R_3$ 是 $C_1$ - $C_4$ 烷基, 更优选地是甲基;  $R_2$ 优选地是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基, 更优选地是三氟甲基; 并且 $G_1$ 是CH或N, 更优选地是N。

[0143] 在具有式I-6的化合物和上述具有式I-6的化合物的所有优选实施例中,  $n$ 是0或1, 更优选地 $n$ 是1; 并且 $R_7$ 和 $R_8$ 是如上式I下所定义的。具有式I-6的化合物的所述尤其优选组的

另一个优选的实施例包括其中的 $R_7$ 和 $R_8$ 彼此独立地是 $C_1$ - $C_6$ 烷基,甚至更优选地是甲基或乙基的化合物;或者 $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成四至六元饱和环系统,优选地所述环系统是未取代的,并且所述环系统不包含氧原子或包含一个氧原子;或更优选地, $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成不含有氧原子的四元的饱和的并且未取代的环系统或形成含有一个氧原子的六元的饱和的并且未取代的环系统。

[0144] 具有式I的化合物的另一个优选组由具有式I-7的化合物表示



[0146] 其中

[0147] A是N或CH;特别地A是N;

[0148]  $R_2$ 是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、优选地三氟甲基;

[0149]  $G_1$ 是N或CH,优选 $G_1$ 是N;

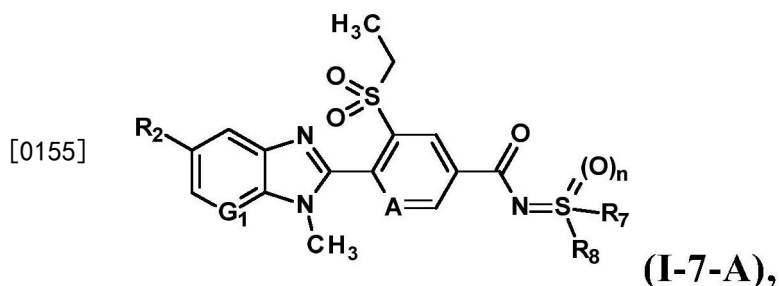
[0150] n是0或1,优选n是1;

[0151]  $R_7$ 和 $R_8$ 彼此独立地是 $C_1$ - $C_6$ 烷基,优选地是甲基或乙基;或者

[0152]  $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成六元饱和环系统,优选地所述环系统是未取代的,并且所述环系统含有一个氧原子;或者

[0153]  $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成四元饱和环系统,所述环系统不含有氧原子;优选地,所述环系统是未取代的。

[0154] 具有式I的化合物的另一个优选组由具有式I-7-A的化合物表示



[0156] 其中

[0157] A是N或CH;

[0158]  $R_2$ 是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、优选地三氟甲基;

[0159]  $G_1$ 是N;

[0160] n是1;

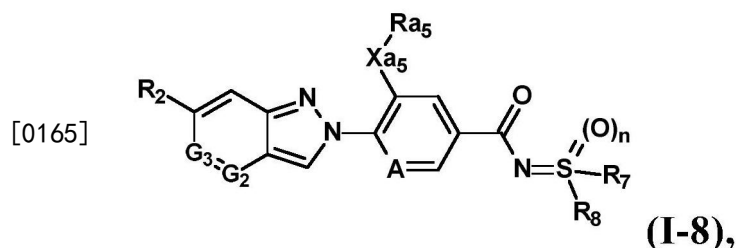
[0161]  $R_7$ 和 $R_8$ 彼此独立地是 $C_1$ - $C_6$ 烷基,优选地是甲基或乙基;或者

[0162]  $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成六元饱和环系统,优选地所述环系统是未取代的,并且所述环系统含有一个氧原子;或者

[0163]  $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成四元饱和环系统,所述环系统不含有氧原

子;优选地,所述环系统是未取代的。

[0164] 具有式I的化合物的另一个优选组由具有式I-8的化合物表示

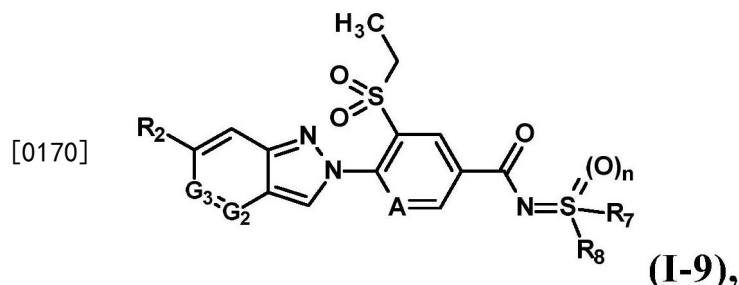


[0166] 其中 $R_2$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 、 $A$ 、 $n$ 、 $R_7$ 和 $R_8$ 是如上式I下所定义的;并且其中 $Xa_5$ 是S、SO或 $SO_2$ ;  $Ra_5$ 是甲基、乙基、正丙基、异丙基或环丙基甲基。

[0167] 在具有式I-8的化合物的所述优选的组中, $A$ 是N;  $Xa_5$ 优选地是S或 $SO_2$ ,更优选地是 $SO_2$ ;并且 $Ra_5$ 优选地是乙基。在具有式I-8的化合物的另一个优选的组中, $A$ 优选地是CH;  $Xa_5$ 优选地是S或 $SO_2$ ,更优选地是 $SO_2$ ;并且 $Ra_5$ 优选地是乙基。在具有式I-8的化合物的另一个优选的组中, $R_2$ 优选地是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基,更优选地是三氟甲基;  $G_2$ 优选是CH;并且 $G_3$ 优选是N。

[0168] 在具有式I-8的化合物和上述具有式I-8的化合物的所有优选实施例中, $n$ 是0或1,更优选地 $n$ 是1;并且 $R_7$ 和 $R_8$ 是如上式I下所定义的。具有式I-8的化合物的所述尤其优选组的另一个优选的实施例包括其中的 $R_7$ 和 $R_8$ 彼此独立地是 $C_1$ - $C_6$ 烷基,甚至更优选地是甲基或乙基的化合物;或 $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成四至六元饱和环系统,所述环系统可以包含一个氧原子;优选地,所述环系统是未取代的,并且所述环系统不包含氧原子或含有一个氧原子。

[0169] 具有式I的化合物的另一个优选组由具有式I-9的化合物表示



[0171] 其中

[0172]  $A$ 是N或CH;

[0173]  $R_2$ 是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、优选三氟甲基;

[0174]  $G_2$ 优选是CH;

[0175]  $G_3$ 优选是N;

[0176]  $n$ 是0或1,优选 $n$ 是1;

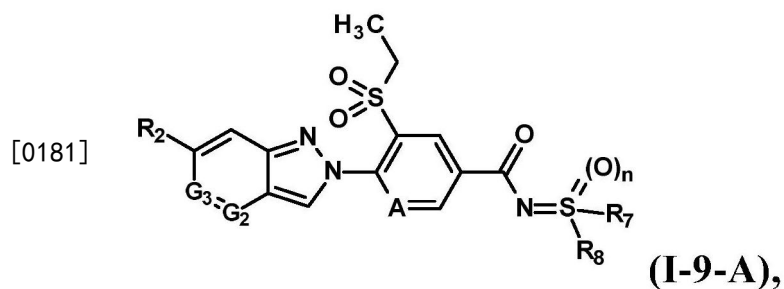
[0177]  $R_7$ 和 $R_8$ 彼此独立地是 $C_1$ - $C_6$ 烷基,优选地是甲基或乙基;或者

[0178]  $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成六元饱和环系统,所述环系统可以含有一个氧原子;优选地,所述环系统是未取代的,并且所述环系统含有一个氧原子;或者

[0179]  $R_7$ 和 $R_8$ 与它们所附接的硫原子一起形成四元饱和环系统,所述环系统不含有氧原子;优选地,所述环系统是未取代的。

[0180] 具有式I的化合物的另一个优选组由具有式I-9-A的化合物表示





[0182] 其中

[0183] A是N;

[0184] R<sub>2</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、优选三氟甲基;

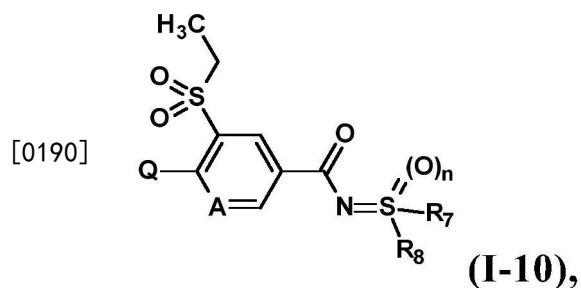
[0185] G<sub>2</sub>是CH;

[0186] G<sub>3</sub>是N;

[0187] n是1;并且

[0188] R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>彼此独立地是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基,优选地是甲基或乙基。

[0189] 具有式I的化合物的特别优选的组由具有式I-10的化合物表示



[0191] 其中

[0192] A是CH或N;

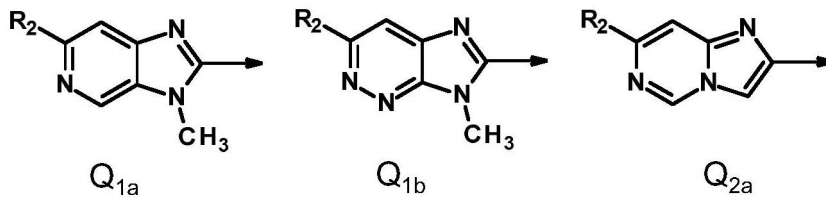
[0193] n是0或1;

[0194] R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>彼此独立地是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基,优选地是甲基或乙基;或者

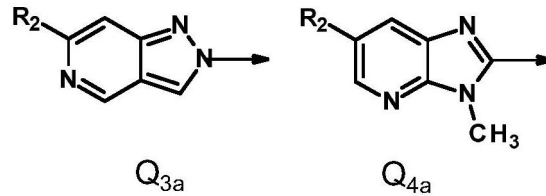
[0195] R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>与它们所附接的硫原子一起形成六元饱和环系统,所述环系统可以含有一个氧原子;优选地,所述环系统是未取代的,并且所述环系统包含一个氧原子;或者

[0196] R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>与它们所附接的硫原子一起形成四元饱和环系统,所述环系统不含有氧原子;优选地,所述环系统是未取代的;并且

[0197] Q是选自由以下组成的组的基团:式Q<sub>1a</sub>、Q<sub>1b</sub>、Q<sub>2a</sub>、Q<sub>3a</sub>和Q<sub>4a</sub>



[0198]

[0199] 特别是选自自由以下组成的组的基团：式Q<sub>1a</sub>、Q<sub>1b</sub>和Q<sub>2a</sub>，

[0200] 其中箭头指示与掺入了基团A的环的附接点；

[0201] 并且其中

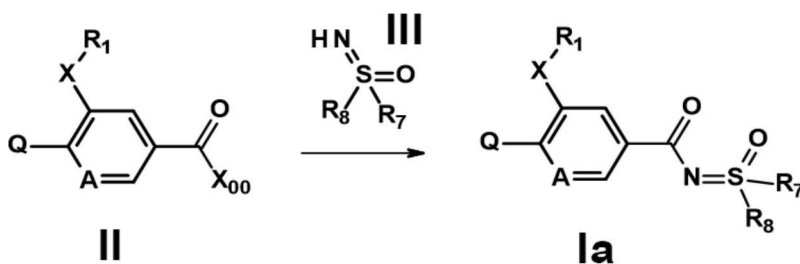
[0202] R<sub>2</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基，优选地是三氟甲基。

[0203] 根据本发明所述的化合物可以具有任何数量的益处，尤其包括针对保护植物对抗昆虫的有利水平的生物活性或对于用作农用化学品活性成分的优越特性（例如，更高的生物活性、有利的活性谱、增加的安全性、改进的物理-化学特性、或增加的生物可降解性）。具体而言，现在已经出人意料地发现某些具有式(I)的化合物相对于非靶标节肢动物特别是传粉者（如蜜蜂、独居蜂和熊蜂）可以显示出有利的安全性。最特别地，相对于意大利蜂（*Apis mellifera*）。

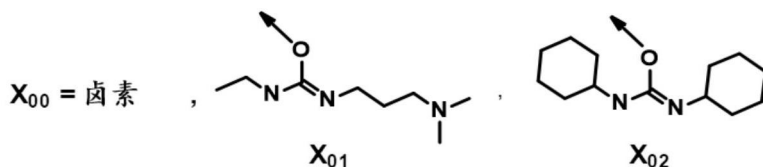
[0204] 根据本发明的用于制备具有式I的化合物的方法原则上通过本领域的技术人员已知的方法进行。更具体地，具有式I的化合物的子组（其中X是SO（亚砷）和/或SO<sub>2</sub>（砷））可以借助对应的具有式I的硫化物（其中X是S）的氧化反应来获得，该氧化反应涉及试剂例如像间氯过氧苯甲酸（mCPBA）、过氧化氢、过硫酸氢钾（oxone）、高碘酸钠、次氯酸钠或次氯酸叔丁酯（除其他氧化剂之外）。该氧化反应通常是在溶剂的存在下进行的。待用于该反应的溶剂的实例包括脂族卤代烃，如二氯甲烷和氯仿；醇，如甲醇和乙醇；乙酸；水；及其混合物。用于该反应的氧化剂的量相对于1摩尔生成亚砷化合物I的硫化物I通常为1摩尔至3摩尔，优选1摩尔至1.2摩尔，并且相对于1摩尔生成砷化合物I的硫化物I优选地为2摩尔至2.2摩尔的氧化剂。此类氧化反应例如公开于W0 2013/018928中。

[0205] 其中n是1的具有式I的化合物的亚组（限定具有式Ia的化合物，其中X、R<sub>1</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、A和Q如式I中所定义）

[0206] 方案1：

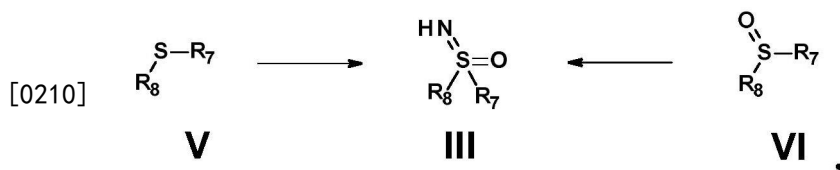


[0207]



[0208] 可以通过以下来制备:任选地在酰化催化剂(例如4-二甲基氨基吡啶(DMAP))存在下,优选地在碱(例如三乙胺、二异丙基乙胺或吡啶)存在下,在惰性溶剂中在0和50°C之间的温度下使具有式II的化合物(其中X、R<sub>1</sub>、A和Q是如式I中定义,并且其中X<sub>00</sub>是离去基团(例如卤素,优选氯),或其中X<sub>00</sub>是基团X<sub>01</sub>或X<sub>02</sub>(其中箭头指示与化合物II的羰基C=O部分的附接点))与具有式III的试剂HN=S(O)R<sub>7</sub>R<sub>8</sub>(或其盐)(其中R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>是如式I中定义(方案1))反应。待使用的溶剂的实例包括醚,如四氢呋喃、乙二醇二甲醚、叔丁基甲基醚和1,4-二噁烷;芳香烃,如甲苯和二甲苯;卤代烃,如二氯甲烷和氯仿;腈,如乙腈;或极性非质子溶剂,如N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基-2-吡咯烷酮或二甲亚砜。某些碱(如吡啶和三乙胺)可以成功地用作碱和溶剂。

[0209] 具有式III的化合物(其中R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>如式I中所定义的)或者是可商购获得的已知化合物,或者可通过文献中描述的已知方法制备,所述文献例如Journal of the Chemical Society[美国化学会志],3004-5;1965或e-EROS Encyclopedia of Reagents for Organic Synthesis[有机合成试剂百科全书],1-8;2013。有利的是具有式III的化合物的制备方法,所述方法从容易获得的具有式V的硫化物化合物开始(参见Chem. Commun.[化学通讯]53,348-351;2017以及其中引用的其他参考文献),或从相应具有式VI的亚砷化合物(参见Angewandte Chemie, International Edition[德国应用化学杂志国际版],55,7203-7207;2016以及其中引用的其他参考文献)(其中R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>是如在式I中定义)开始,



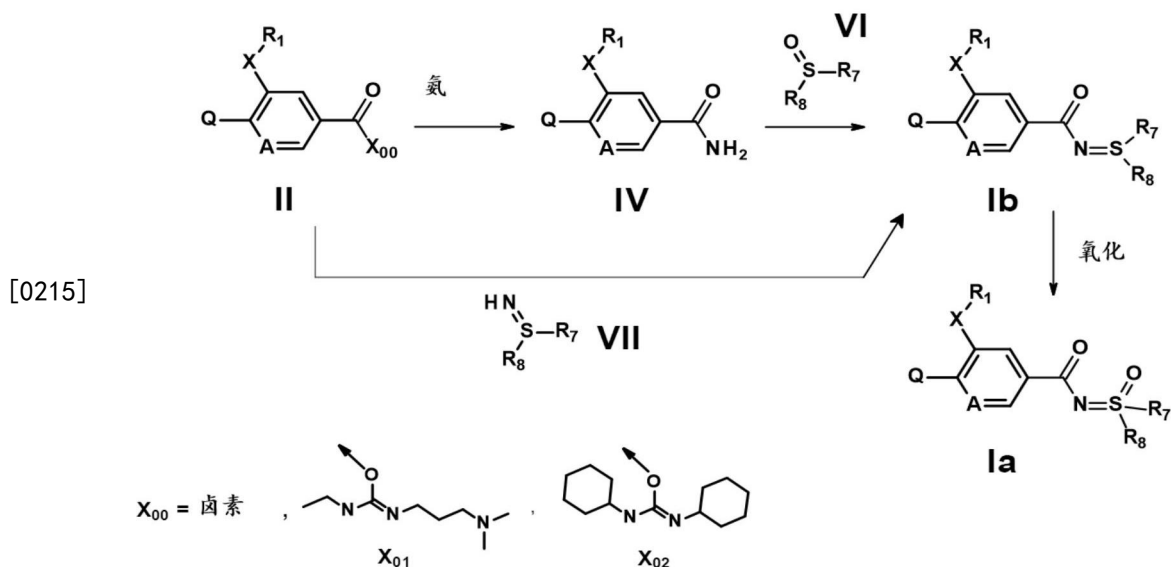
[0210]

[0211] 所述方法涉及,例如,以氨、氨基甲酸铵或乙酸铵作为合适的氮源,并且在溶剂(如甲苯、乙腈或甲醇)中,在0°C与100°C之间的温度下(优选室温附近),由高价碘试剂(如二乙酰氧基碘苯)介导。

[0212] 具有式V的化合物和具有式VI的化合物(其中R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>是如式I中所定义的)是已知的化合物、可商购的或可通过文献中描述的已知方法制备。特别地,具有式V的化合物可以在上文已经描述的标准氧化条件下被氧化为具有式VI的化合物。

[0213] 替代性地,具有式Ia的化合物(其中X、R<sub>1</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、A和Q如式I中所定义)

## [0214] 方案2



[0216] 可以通过从其中n是0的具有式I的化合物的亚组(限定具有式Ib的化合物,其中X、 $R_1$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、A和Q如式I中所定义)的氧化步骤来制备(方案2)。在这样的转化中,可以使用经典的氧化试剂,例如 $\text{KMnO}_4$  (European Journal of Organic Chemistry [欧洲有机化学杂志], 2013 (34), 7800-7808; 2013)、 $\text{NaMnO}_4$ 、mCPBA、 $\text{NaIO}_4/\text{RuO}_2$  (Tetrahedron Letters [四面体通讯], (6), 503-6; 1978)、 $\text{NaIO}_4/\text{RuCl}_3 \cdot \text{H}_2\text{O}_2$  (任选地在催化剂的存在下,例如像钨酸钠 $\text{Na}_2\text{WO}_4$ ; WO 07/006670)、或过硫酸氢钾复合盐(oxone)。另外可以与在例如WO 2008/097235和WO 2008/106006 (涉及使用钨盐与碱金属高碘酸盐组合以及可替代地涉及使用碱金属高锰酸盐)中发现的描述类似地进行这种氧化。用于氧化的合适溶剂是例如二氯甲烷、氯仿、甲醇、乙醇、水或乙酸、或其混合物,温度范围为 $-10^\circ\text{C}$ 至 $50^\circ\text{C}$ ,优选在 $10^\circ\text{C}$ 与 $30^\circ\text{C}$ 之间。

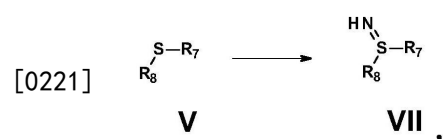
[0217] 可以通过以下来制备具有式Ib的化合物(其中X、 $R_1$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、A和Q是如式I中所定义的):例如通过涉及五氧化二磷 (Monatsh. Chem. [化学月报] 101, 396-404; 1970) 或三氟乙酸酐 (J. Org. Chem. [有机化学杂志] 40, 2758-2764; 1975), 在三乙胺存在下,且在如氯仿或二氯甲烷的溶剂中,在 $-80^\circ\text{C}$ 与 $100^\circ\text{C}$ 之间、优选 $-70^\circ\text{C}$ 与 $60^\circ\text{C}$ 之间的温度下,使具有式IV的化合物(其中X、 $R_1$ 、A和Q是如式I中所定义的)与具有式VI的亚砷试剂 $\text{S}(\text{O})\text{R}_7\text{R}_8$  (其中 $R_7$ 和 $R_8$ 是如式I中所定义的)反应。

[0218] 具有式IV的化合物(其中X、 $R_1$ 、A和Q是如式I中所定义的)可以通过以下来制备:任选地在酰化催化剂(例如4-二甲基氨基吡啶(DMAP))存在下,优选地在碱(例如三乙胺、二异丙基乙胺或吡啶)存在下,在惰性溶剂中在0与 $50^\circ\text{C}$ 之间的温度下,使具有式II的化合物(其中X、 $R_1$ 、A和Q是如式I中所定义的,并且其中 $X_{00}$ 是离去基团(例如卤素,优选氯)或其中 $X_{00}$ 是基团 $X_{01}$ 或 $X_{02}$ (其中箭头指示与化合物II的羰基 $\text{C}=\text{O}$ 部分的附接点))与氨 $\text{NH}_3$ (或其盐)或氨等效物(例如像氢氧化铵 $\text{NH}_4\text{OH}$ 、氯化铵 $\text{NH}_4\text{Cl}$ 、乙酸铵 $\text{NH}_4\text{OAc}$ 、碳酸铵 $(\text{NH}_4)_2\text{CO}_3$ 和其他 $\text{NH}_3$ 替代物)反应。待使用的溶剂的实例包括醚,例如四氢呋喃、乙二醇二甲醚、叔丁基甲基醚和1,4-二噁烷;酯,例如乙酸乙酯;芳香烃,如甲苯和二甲苯;卤代烃,如二氯甲烷和氯仿;腈,如乙腈;或极性非质子溶剂,如N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基-2-吡咯烷酮或二甲亚砜;或水;或其混合物。某些碱(如吡啶和三乙胺)可以成功地用作碱和溶剂。

[0219] 可替代地,具有式Ib的化合物(其中X、 $R_1$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、A和Q是如式I中所定义的)可以通

过以下来制备:任选地在酰化催化剂(例如4-二甲基氨基吡啶(DMAP))存在下,优选地在碱(例如三乙胺、二异丙基乙胺或吡啶)存在下,在惰性溶剂中在0与50°C之间的温度下使具有式II的化合物(其中X、R<sub>1</sub>、A和Q是如式I中所定义的,并且其中X<sub>00</sub>是离去基团(例如卤素,优选氯),或其中X<sub>00</sub>是基团X<sub>01</sub>或X<sub>02</sub>(其中箭头指示与化合物II的羰基C=O部分的附接点))与具有式VII的硫亚胺试剂S(NH)R<sub>7</sub>R<sub>8</sub>(或其盐)(其中R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>是如式I中所定义的)反应。待使用的溶剂的实例包括醚,例如四氢呋喃、乙二醇二甲醚、叔丁基甲基醚和1,4-二噁烷;芳香烃,例如甲苯和二甲苯;卤代烃,如二氯甲烷和氯仿;腈,例如乙腈;或极性非质子溶剂,例如N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基-2-吡咯烷酮或二甲亚砜。某些碱(如吡啶和三乙胺)可以成功地用作碱和溶剂。

[0220] 具有式VII的化合物(或其盐)(其中R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>是如式I中所定义的)是已知化合物,可商购获得或可以通过已知方法制备,特别是可以方便地由具有式V的硫化物(其中R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>是如式I中所定义的)制备,

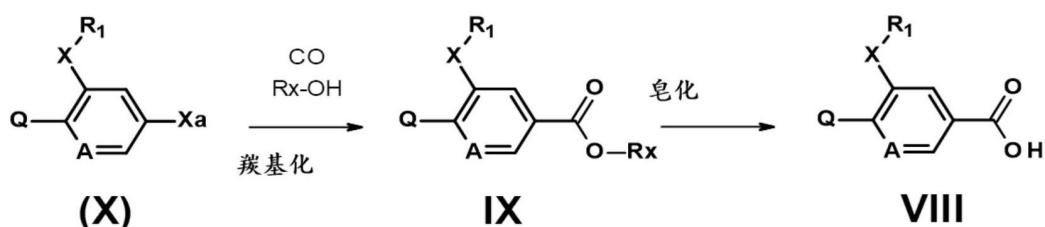


[0222] 如文献中所述,例如Justus Liebigs Annalen der Chemie[贾斯特斯利比希化学纪事],618,53-8,1958;

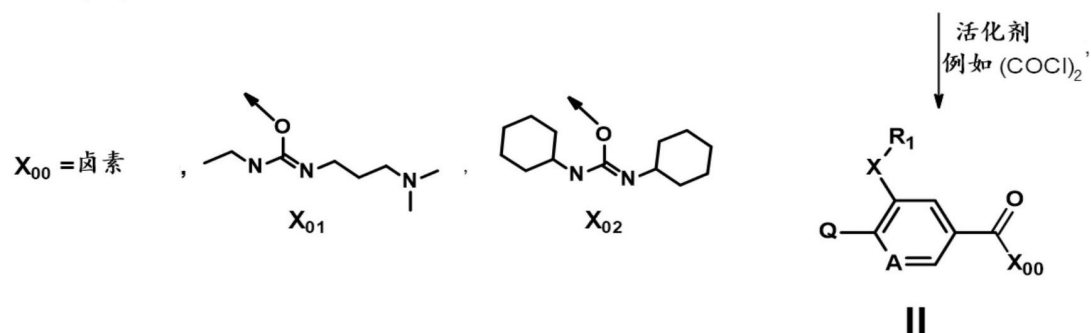
[0223] Chemische Berichte[德国化学学报],99(10),3108-17,1966;Tetrahedron Letters[四面体通讯],(40),4137-40,1972;或WO 2014/053401。

[0224] 具有式II的化合物(其中X、R<sub>1</sub>、A和Q是如式I中所定义的,并且其中X<sub>00</sub>是离去基团(例如卤素,优选氯),或其中X<sub>00</sub>是基团X<sub>01</sub>或X<sub>02</sub>(其中箭头表示与化合物II的羰基C=O部分的附接点),

[0225] 方案3:



[0226]



[0227] 可以通过本领域技术人员已知并且例如在Tetrahedron[四面体],2005,61(46),10827-10852(方案3)中描述的方法,通过具有式VIII的化合物(其中X、R<sub>1</sub>、A和Q如式I中所定义的)的活化来制备。例如,化合物II(其中是卤素,优选氯)典型地是通过在20°C至100°C之间(优选25°C)的温度下,在惰性溶剂(如二氯甲烷CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>或四氢呋喃THF)中,在催化量的

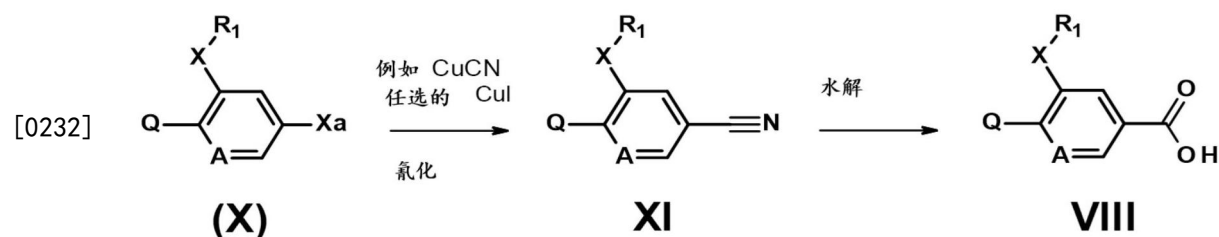
N,N-二甲基甲酰胺DMF的存在下,用例如草酰氯(COCl)<sub>2</sub>或亚硫酰氯SOCl<sub>2</sub>处理化合物VIII而形成的。可替代地,在20°C-180°C之间的温度下,任选地在碱(如三乙胺)的存在下,在惰性溶剂(如吡啶或四氢呋喃THF)中,用例如1-乙基-3-(3-二甲基氨基丙基)碳二亚胺EDC(也称为EDAC或EDCI)或二环己基碳二亚胺DCC处理具有式VIII的化合物将产生活物质II(其中X<sub>00</sub>分别是X<sub>01</sub>或X<sub>02</sub>)。

[0228] 具有式VIII的化合物(其中X、R<sub>1</sub>、A和Q是如式I中所定义的)可以通过以下来制备:在本领域技术人员已知的条件(使用例如以下条件如:甲醇、乙醇、四氢呋喃或二噁烷中的水性的氢氧化钠、氢氧化钾或氢氧化锂,在室温下,或最高达回流条件)下,皂化相应的具有式IX的酯化合物(其中X、R<sub>1</sub>、A和Q是如式I中所定义的,并且其中R<sub>x</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)。可替代地,在溶剂(例如N,N-二甲基甲酰胺,N,N-二甲基乙酰胺或N-甲基-2-吡咯烷酮)中用卤化物阴离子(优选氯离子,例如源自氯化锂(或可替代地氯化钠或氯化钾))处理具有式IX的酯化合物也可以产生具有式VIII的羧酸化合物。这种O-脱甲基化的反应温度范围优先地从20°C至反应混合物的沸点,或者该反应可以在微波辐射下进行。

[0229] 具有式IX的化合物(其中X、R<sub>1</sub>、A和Q是如式I中所定义的,并且其中R<sub>x</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)可以通过羰基化反应从具有式(X)的化合物(其中X、R<sub>1</sub>、A和Q是如式I中所定义的,并且其中X<sub>a</sub>是离去基团(比如例如氯、溴或碘(优选氯或溴)),或芳基-、烷基-或卤代烷基磺酸酯(例如三氟甲磺酸酯)来制备。在此类烷基羰基化中,通常在压力下,在金属催化剂(例如钯催化剂(例如:乙酸钯(II);[1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁]氯化钯(II)Pd(dppf)Cl<sub>2</sub>;双(三苯基膦基)二氯化钯(II)PdCl<sub>2</sub>(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>;双(二苯基膦基)丙烷]钯(II)PdCl<sub>2</sub>(dipp)))存在下,任选地在膦配体(例如三苯基膦或1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁)存在下,在醇R<sub>x</sub>OH溶剂(通常在甲醇或乙醇)(其中R<sub>x</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)中,任选地在共溶剂(例如甲苯、二噁烷或N,N-二甲基甲酰胺)的存在下,并且优选地在碱(例如像三甲胺)存在下,在20°与200°C之间、优选在50°与180°C之间的温度下,具有式(X)的化合物与一氧化碳CO反应。

[0230] 可替代地,具有式VIII的化合物(其中X、R<sub>1</sub>、A和Q是如式I中所定义的),

[0231] 方案4:



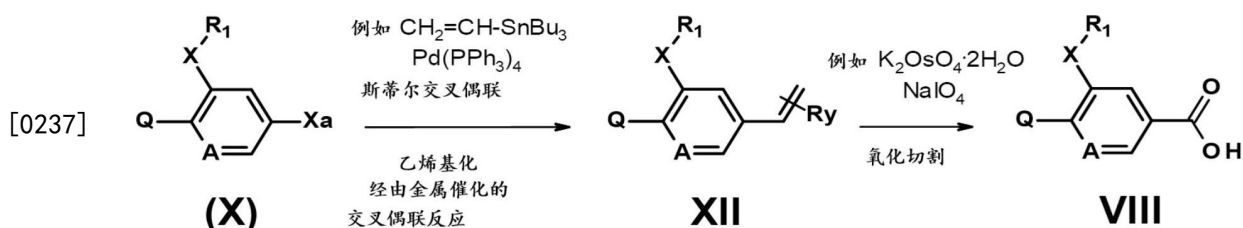
[0233] 可以通过以下来制备(方案4):在酸性或碱性条件下水解具有式XI的化合物(其中X、R<sub>1</sub>、A和Q是如式I中所定义的),参见例如Synthetic Organic Methodology, Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations[合成有机物方法论,全面的有机物转化:官能团制备指南],Larock, R.C.1989,第993页。通常,任选地在惰性溶剂(例如醚(例如四氢呋喃,乙二醇二甲基醚或1,4-二噁烷))存在下,在范围从室温至180°C、优选在50°C至反应混合物的沸点之间的温度下,用水性酸(例如盐酸HCl或硫酸(例如50%硫酸水溶液)处理具有式XI的化合物。此类水解条件以及其变体是本领域技术人员已知的。

[0234] 具有式XI的化合物(其中X、R<sub>1</sub>、A和Q是如式I中所定义的)可以通过具有式(X)的化

合物(其中X、R<sub>1</sub>、A和Q是如式I中所定义的,并且其中X<sub>a</sub>是离去基团(例如像氯、溴或碘(优选氯或溴)),或芳基-、烷基-或卤代烷基磺酸酯(例如三氟甲磺酸酯)的氰化来制备。在此类反应中,任选地在另外的铜催化剂(例如碘化铜(I))存在下,在溶剂(例如二甲基亚砷、N-甲基吡咯烷酮,N,N-二甲基甲酰胺或N,N-二甲基乙酰胺)中,在0与200°C之间、优选在50°C与180°C之间的温度下,任选地在微波辐射下,具有式(X)的化合物与氰化物源(如氰化铜(I))反应。可替代地,这种转化可以在钯或镍催化下用例如氰化锌来实现(参见例如Med.Chem.Commun.[医学化学通讯],2010,1,309-318)。

[0235] 可替代地,具有式VIII的化合物(其中X、R<sub>1</sub>、A和Q是如式I中所定义的),

[0236] 方案5:



[0238] 可以通过以下来制备(方案5):氧化切割具有式XII的烯炔化合物(其中X、R<sub>1</sub>、A和Q如式I中所定义的,且其中烯炔部分可是被R<sub>y</sub>单、二或三取代的,并且其中R<sub>y</sub>是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基或苯基(优选R<sub>y</sub>是氢)。氧化切割条件包括例如:在共氧化剂(例如臭氧(具体参见J.Am.Chem.Soc.[美国化学学会杂志]2002,124,3824-3825)或高碘酸钠NaIO<sub>4</sub>)存在下,在溶剂(例如丙酮、叔丁醇、N,N-二甲基甲酰胺或1,4-二噁烷)中,通常在与水的混合物中,在0与80°C之间、优选在0°C与室温之间的温度下,使用四氧化锇OsO<sub>4</sub>(可替代地,氧化锰、氧化钨或氧化钨试剂)或其替代物(如二水合锇酸二钾(K<sub>2</sub>OsO<sub>4</sub>·2H<sub>2</sub>O))。这样的反应可以用源自具有式XII的化合物的相应的1,2-二醇和/或醛的中间体进行,所述中间体可以被分离,但是有利地,具有式XII的烯炔被直接氧化切割为具有式VIII的羧酸。涉及OsO<sub>4</sub>和NaIO<sub>4</sub>的这类转化在文献(如例如描述于Eur.J.Org.Chem[有机化学杂志].2014,5664-5669中)中是已知的。

[0239] 具有式XII的化合物(其中X、R<sub>1</sub>、A和Q是如式I中所定义的,并且其中烯炔部分可以被R<sub>y</sub>单取代、二取代或三取代,其中R<sub>y</sub>是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基或苯基(优选地R<sub>y</sub>是氢))可以通过以下来制备:具有式(X)的化合物(其中X、R<sub>1</sub>、A和Q是如式I中所定义的,并且其中X<sub>a</sub>是离去基团(比如例如氯、溴或碘(优选氯或溴),或芳基-、烷基-或卤代烷基磺酸酯(例如三氟甲磺酸酯)在金属催化的交叉偶联反应条件下的烯炔化(Modern Arylation Methods[现代芳基化方法],作者Lutz Ackermann,Wiley,2009)。特别地,具有式XII的化合物可以通过具有式(X)的化合物与适当的锡试剂(三烷基锡衍生物,优选三正丁基锡),例如像三丁基(乙烯基)锡(其中R<sub>y</sub>优选是氢)之间的斯蒂尔(Stille)反应来制备。此类斯蒂尔反应通常是在钯催化剂(例如四(三苯基膦)钯(0)或双(三苯基膦)二氯钯(II))的存在下,在惰性溶剂(例如N,N-二甲基甲酰胺、乙腈、甲苯或二噁烷)中,任选地在添加剂(如氟化铯或氯化锂)的存在下,并任选地在另外的催化剂(例如碘化铜(I))的存在下进行。这类斯蒂尔偶联也是本领域技术人员熟知的,并且已经在例如J.Org.Chem.[有机化学杂志],2005,70,8601-8604,J.Org.Chem.[有机化学杂志],2009,74,5599-5602,和Angew.Chem.Int.Ed.[德国应用化学国际版],2004,43,1132-1136中描述。

[0240] 其中X、R<sub>1</sub>、A和Q如式I中所定义并且其中Xa是离去基团的具有式(X)的化合物,特别是那些其中Xa是卤素的化合物,是已知的化合物,或者可以通过已知的方法制备,或者可以类似于文献中描述的方法合成。具体参见WO 2016/071214(Q是Q<sub>2</sub>,G<sub>3</sub>是N)和WO 2015/000715(Q是Q<sub>2</sub>,G<sub>3</sub>是CH)、WO 2016/026848和WO 2016/005263(Q是Q<sub>1</sub>,G<sub>1</sub>是CH)、WO 2016/059145(Q是Q<sub>1</sub>,G<sub>1</sub>是N)、WO 2016/020286和WO 2017/134066(Q是Q<sub>3</sub>)和WO 2012/086848、WO 2013/018928(Q是Q<sub>4</sub>)。

[0241] 某些具有式VIII和/或IX的化合物(其中X、R<sub>1</sub>、A和Q是如式I中所定义的,并且其中R<sub>x</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)在文献中是已知的,具体参见WO 17/146221、WO 16/104746、WO 14/142292、WO 14/132972和WO 14/123206。

[0242] 反应物可以在碱的存在下反应。合适的碱的实例是碱金属或碱土金属氢氧化物、碱金属或碱土金属氢化物、碱金属或碱土金属酰胺、碱金属或碱土金属醇盐、碱金属或碱土金属乙酸盐、碱金属或碱土金属碳酸盐、碱金属或碱土金属二烷基酰胺或碱金属或碱土金属烷基甲硅烷基酰胺、烷基胺、亚烷基二胺、游离的或N-烷基化的饱和或不饱和的环烷基胺、碱性杂环、氢氧化铵以及碳环胺。可提及的实例是氢氧化钠、氢化钠、氨基钠、甲醇钠、乙酸钠、碳酸钠、叔丁醇钾、氢氧化钾、碳酸钾、氢化钾、二异丙基氨基锂、双(三甲基甲硅烷基)氨基钾、氢化钙、三乙胺、二异丙基乙胺、三亚乙基二胺、环己胺、N-环己基-N,N-二甲基胺、N,N-二乙基苯胺、吡啶、4-(N,N-二甲基氨基)吡啶、奎宁环、N-甲基吗啉、苄基三甲基氢氧化铵和1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯(DBU)。

[0243] 反应物可以原样相互反应,即不添加溶剂或稀释剂。然而,在大多数情况下,添加惰性溶剂或稀释剂或这些物质的混合物是有利的。如果反应在碱存在下进行,则过量使用的碱如三乙胺、吡啶、N-甲基吗啉或N,N-二乙基苯胺也可用作溶剂或稀释剂。

[0244] 该反应有利地是在从约-80℃至约+140℃,优选从约-30℃至约+100℃的温度范围内,在许多情况下在环境温度与约+80℃之间的范围内进行。

[0245] 具有式I的化合物能以本身已知的方式转化为另一种具有式I的化合物,这是通过以常规方式将具有式I的起始化合物的一个或多个取代基用根据本发明的其他一个或多个取代基的替代来实现的。

[0246] 取决于所选的适合各自情况的反应条件以及起始材料,有可能例如,在一个反应步骤中仅将一个取代基用根据本发明的另一个取代基替代,或者在同一个反应步骤中可以将多个取代基用多个根据本发明的其他取代基来替代。

[0247] 具有式I的这些化合物的盐能以本身已知的方式进行制备。因此,例如,具有式I的化合物的酸加成盐是通过用合适的酸或合适的离子交换剂试剂进行处理来获得的,并且与碱的盐是通过用合适的碱或用合适的离子交换剂试剂进行处理来获得的。

[0248] 具有式I的化合物的盐能以常规方式转化为游离的化合物I、酸加成盐(例如通过用合适的碱性化合物或用合适的离子交换剂试剂进行处理)以及与碱的盐(例如通过用合适的酸或用合适的离子交换剂试剂进行处理)。

[0249] 具有式I的化合物的盐能以本身已知的方式转化为具有式I的化合物的其他盐、酸加成盐,例如转化成其他酸加成盐,例如通过在合适的溶剂中用酸的合适的金属盐(如钠、钡或银的盐,例如用乙酸银)来处理无机酸的盐(如盐酸盐),在该溶剂中,所形成的无机盐(例如氯化银)是不溶的并且因此从该反应混合物中沉淀出。



[0250] 取决于程序或反应条件,具有成盐特性的这些具有式I的化合物能以游离形式或盐的形式获得。

[0251] 取决于分子中存在的不对称碳原子的数目、绝对和相对构型和/或取决于分子中存在的非芳香族双键的构型,具有式I的化合物和适当时其互变异构体(在每种情况下呈游离形式或呈盐形式)可以以可能的异构体之一的形式或作为这些的混合物存在,例如以纯异构体的形式,如对映体和/或非对映体,或作为异构体混合物,如对映异构体混合物,例如外消旋体、非对映体混合物或外消旋体混合物存在;本发明涉及纯异构体以及还有所有可能的异构体混合物,并且在上文和下文中在每种情况下都应如此理解,即使当立体化学细节未在每种情况下明确提及时。

[0252] 呈游离形式或呈盐形式的具有式I的化合物的非对映异构体混合物或外消旋体混合物(它们的获得可以取决于已选定的起始材料和程序)能够在这些组分的物理化学差异的基础上,例如通过分步结晶、蒸馏和/或色谱法以已知的方式分离成纯的非对映异构体或外消旋体。

[0253] 能够以类似方式获得的对映异构体混合物(如外消旋体)可以通过已知方法拆分成光学对映体,例如通过从光学活性溶剂再结晶;通过在手性吸附剂上的色谱法,例如在乙酰纤维素上的高效液相色谱法(HPLC);借助于适合的微生物,通过用特异性固定化酶裂解;通过形成包含化合物,例如使用手性冠醚,其中仅一个对映异构体被络合;或通过转化成非对映异构体的盐,例如通过使碱性最终产物外消旋体与光学活性酸(如羧酸,例如樟脑酸、酒石酸或苹果酸,或磺酸,例如樟脑磺酸)反应,并且分离能够以此方式获得的非对映异构体混合物,例如基于其不同溶解度通过分步结晶,从而获得非对映异构体,从所述非对映异构体可以通过合适的试剂(例如碱性试剂)的作用使所希望的对映异构体变成游离的。

[0254] 纯的非对映异构体或对映异构体可以根据本发明来获得,不仅是通过分离适合的异构体混合物,还可以是通过通常已知的非对映立体选择性或对映选择性合成的方法,例如通过根据本发明用具有适合的立体化学的起始材料进行该方法。

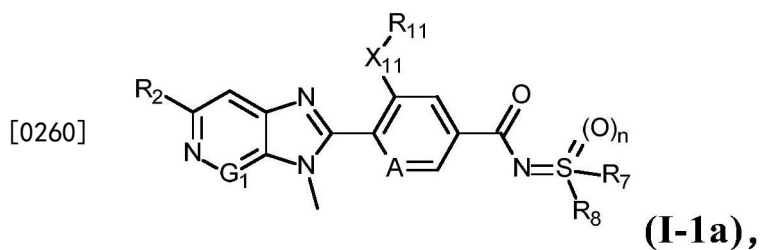
[0255] 可以通过使具有式I的化合物与适合的氧化剂(例如 $H_2O_2$ /尿素加合物)在酸酐(例如三氟乙酸酐)的存在下进行反应来制备N-氧化物。此类氧化从文献,例如从J. Med. Chem. [药物化学杂志]32(12),2561-73,1989或WO 00/15615已知。

[0256] 如果单个组分具有不同的生物活性,则有利的是在每一情况下分离或合成生物学上更有效的异构体,例如对映异构体或非对映异构体或异构体混合物,例如对映异构体混合物或非对映异构体混合物。

[0257] 如果适当的话,具有式I的化合物和适当时其互变异构体(在每种情况下呈游离形式或呈盐形式)还能以水合物的形式获得和/或包括其他溶剂,例如可以用于使以固体形式存在的化合物结晶的那些。

[0258] 根据下表1至12的化合物可以按照上述方法制备。以下实例旨在说明本发明并示出具有式I的优选化合物。

[0259] 表1:此表披露了28种具有式I-1a的化合物1.001至1.028:



[0261] 其中 $X_{11}$ 是S,并且A、 $R_{11}$ 、 $G_1$ 、 $R_2$ 、n、 $R_7$ 和 $R_8$ 如下定义:

[0262] 表1:

化合物编号	A	$R_{11}$	$G_1$	$R_2$	n	$R_7$	$R_8$
1.001	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
1.002	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1.003	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1.004	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	
1.005	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	
1.006	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
1.007	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1.008	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1.009	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	
1.010	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	
[0263] 1.011	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
1.012	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1.013	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1.014	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
1.015	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1.016	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1.017	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
1.018	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1.019	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1.020	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
1.021	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1.022	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1.023	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
1.024	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1.025	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

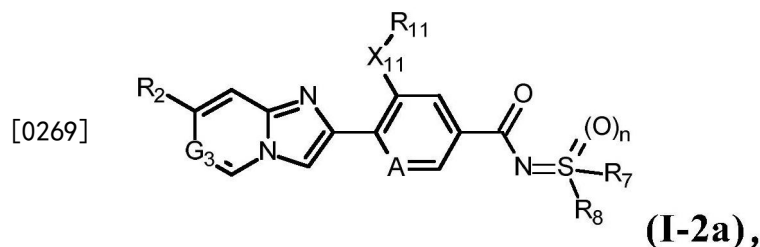
化合物编号	A	R <sub>11</sub>	G <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	n	R <sub>7</sub>	R <sub>8</sub>
[0264] 1.026	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
1.027	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1.028	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

[0265] 以及表1的化合物的N-氧化物。

[0266] 表2: 该表披露了28种具有式I-1a的化合物2.001至2.028, 其中X<sub>11</sub>是SO, 并且A、R<sub>11</sub>、G<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、n、R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>如表1中所定义。

[0267] 表3: 该表披露了28种具有式I-1a的化合物3.001至3.028, 其中X<sub>11</sub>是SO<sub>2</sub>, 并且A、R<sub>11</sub>、G<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、n、R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>如表1中所定义。

[0268] 表4: 此表披露了26种具有式I-2a的化合物4.001至4.026:



[0270] 其中X<sub>11</sub>是S, 并且A、R<sub>11</sub>、G<sub>3</sub>、R<sub>2</sub>、n、R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>如下定义:

[0271] 表4:

化合物编号	A	R <sub>11</sub>	G <sub>3</sub>	R <sub>2</sub>	n	R <sub>7</sub>	R <sub>8</sub>
4.001	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
4.002	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
4.003	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
[0272] 4.004	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	
4.005	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	
4.006	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
4.007	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
4.008	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
4.009	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

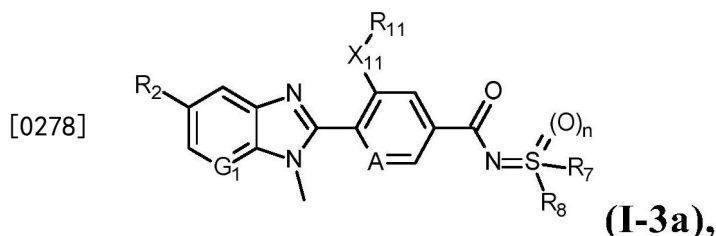
化合物 编号	A	R <sub>11</sub>	G <sub>3</sub>	R <sub>2</sub>	n	R <sub>7</sub>	R <sub>8</sub>
4.010	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
4.011	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
4.012	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
4.013	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
4.014	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
4.015	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
4.016	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
[0273] 4.017	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
4.018	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
4.019	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
4.020	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
4.021	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
4.022	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
4.023	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
4.024	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
4.025	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
4.026	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

[0274] 以及表4的化合物的N-氧化物。

[0275] 表5: 该表披露了26种具有式I-2a的化合物5.001至5.026, 其中X<sub>11</sub>是SO, 并且A、R<sub>11</sub>、G<sub>3</sub>、R<sub>2</sub>、n、R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>如表4中所定义。

[0276] 表6: 该表披露了26种具有式I-2a的化合物6.001至6.026, 其中X<sub>11</sub>是SO<sub>2</sub>, 并且A、R<sub>11</sub>、G<sub>3</sub>、R<sub>2</sub>、n、R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>如表4中所定义。

[0277] 表7: 此表披露了26种具有式I-3a的化合物7.001至7.026:



[0279] 其中X<sub>11</sub>是S, 并且A、R<sub>11</sub>、G<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、n、R<sub>7</sub>和R<sub>8</sub>如下定义:

[0280] 表7:

[0281]

化合物编号	A	R <sub>11</sub>	G <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	n	R <sub>7</sub>	R <sub>8</sub>
7.001	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
7.002	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
7.003	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
7.004	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	
7.005	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	
7.006	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
7.007	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
7.008	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
7.009	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
7.010	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
7.011	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
7.012	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
7.013	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
7.014	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
7.015	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
7.016	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
7.017	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
7.018	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
7.019	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
7.020	N	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
7.021	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
7.022	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
7.023	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	1	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

[0282]

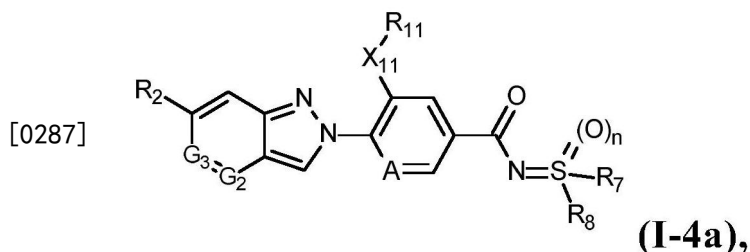
化合物编号	A	R <sub>11</sub>	G <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	n	R <sub>7</sub>	R <sub>8</sub>
7.024	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
7.025	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
7.026	CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF <sub>3</sub>	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

[0283] 以及表7的化合物的N-氧化物。

[0284] 表8: 该表披露了26种具有式I-3a的化合物8.001至8.026, 其中 $X_{11}$ 是 $SO$ , 并且 $A$ 、 $R_{11}$ 、 $G_1$ 、 $R_2$ 、 $n$ 、 $R_7$ 和 $R_8$ 如表7中所定义。

[0285] 表9: 该表披露了26种具有式I-3a的化合物9.001至9.026, 其中 $X_{11}$ 是 $SO_2$ , 并且 $A$ 、 $R_{11}$ 、 $G_1$ 、 $R_2$ 、 $n$ 、 $R_7$ 和 $R_8$ 如表7中所定义。

[0286] 表10: 此表披露了具有式I-4a的14种化合物10.001至10.014:



[0288] 其中 $X_{11}$ 是 $S$ , 并且 $A$ 、 $R_{11}$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 、 $R_2$ 、 $n$ 、 $R_7$ 和 $R_8$ 如下定义:

[0289] 表10:

化合物编号	A	$R_{11}$	$G_2$	$G_3$	$R_2$	n	$R_7$	$R_8$
10.001	N	$-CH_2CH_3$	CH	N	$CF_3$	1	$CH_3$	$CH_3$
10.002	N	$-CH_2CH_3$	CH	N	$CF_3$	1	$CH_3$	$CH_2CH_3$
10.003	N	$-CH_2CH_3$	CH	N	$CF_3$	1	$CH_2CH_3$	$CH_2CH_3$
10.004	N	$-CH_2CH_3$	CH	N	$CF_3$	1	$-CH_2CH_2CH_2-$	
10.005	N	$-CH_2CH_3$	CH	N	$CF_3$	1	$-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$	
10.006	N	$-CH_2CH_3$	CH	N	$CF_3$	0	$CH_3$	$CH_3$
10.007	N	$-CH_2CH_3$	CH	N	$CF_3$	0	$CH_3$	$CH_2CH_3$
10.008	N	$-CH_2CH_3$	CH	N	$CF_3$	0	$CH_2CH_3$	$CH_2CH_3$

[0290]

化合物编号	A	$R_{11}$	$G_2$	$G_3$	$R_2$	n	$R_7$	$R_8$
10.009	CH	$-CH_2CH_3$	CH	N	$CF_3$	1	$CH_3$	$CH_3$
10.010	CH	$-CH_2CH_3$	CH	N	$CF_3$	1	$CH_3$	$CH_2CH_3$
10.011	CH	$-CH_2CH_3$	CH	N	$CF_3$	1	$CH_2CH_3$	$CH_2CH_3$
10.012	CH	$-CH_2CH_3$	CH	N	$CF_3$	0	$CH_3$	$CH_3$
10.013	CH	$-CH_2CH_3$	CH	N	$CF_3$	0	$CH_3$	$CH_2CH_3$
10.014	CH	$-CH_2CH_3$	CH	N	$CF_3$	0	$CH_2CH_3$	$CH_2CH_3$

[0291]

[0292] 以及表10的化合物的N-氧化物。

[0293] 表11:该表披露了14种具有式I-4a的化合物11.001至11.014,其中 $X_{11}$ 是 $SO$ ,并且 $A$ 、 $R_{11}$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 、 $R_2$ 、 $n$ 、 $R_7$ 和 $R_8$ 如表10中所定义。

[0294] 表12:该表披露了14种具有式I-4a的化合物12.001至12.014,其中 $X_{11}$ 是 $SO_2$ ,并且 $A$ 、 $R_{11}$ 、 $G_2$ 、 $G_3$ 、 $R_2$ 、 $n$ 、 $R_7$ 和 $R_8$ 如表10中所定义。

[0295] 根据本发明的具有式I的化合物在有害生物控制领域中是有预防和/或治疗价值的活性成分,即使是在低的施用量下,它们具有非常有利的杀生物谱并且是温血物种、鱼以及植物良好耐受的。根据本发明的这些活性成分作用于正常敏感的以及还有抗药的动物有害生物(如昆虫或蜱螨目的代表)的所有的或个别的发育阶段。根据本发明的活性成分的杀昆虫或杀螨活性可以本身直接表现出来,即立即或仅在过去一些时间之后(例如在蜕皮期间)发生对有害生物的破坏;或间接表现出来,例如降低产卵和/或孵化率,对应于至少50%至60%的破坏率(死亡率)的良好活性。

[0296] 上述动物有害生物的实例是:

[0297] 来自蜱螨目,例如

[0298] 下毛瘿螨属(*Acalitus* spp.)、针刺瘿螨属(*Aculus* spp.)、窄瘿螨属(*Acaricalus* spp.)、瘤瘿螨属(*Aceria* spp.)、粗脚粉螨(*Acarus siro*)、钝眼蜱属(*Amblyomma* spp.)、锐缘蜱属(*Argas* spp.)、牛蜱属(*Boophilus* spp.)、短须螨属(*Brevipalpus* spp.)、苔螨属(*Bryobia* spp.)、上三节瘿螨属(*Calipitrimerus* spp.)、皮螨属(*Chorioptes* spp.)、鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*)、表皮螨属(*Dermatophagoides* spp.)、始叶螨属(*Eotetranychus* spp.)、瘿螨属(*Eriophyes* spp.)、半跗线螨属(*Hemitarsonemus* spp.)、璃眼蜱属(*Hyalomma* spp.)、硬蜱属(*Ixodes* spp.)、小爪螨属(*Olygonychus* spp.)、钝缘蜱属(*Ornithodoros* spp.)、侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonella latus*)、全爪螨属(*Panonychus* spp.)、桔芸锈螨(*Phyllocoptruta oleivora*)、植食螨(*Phytonemus* spp.)、跗线螨属(*Polyphagotarsonemus* spp.)、痒螨属(*Psoroptes* spp.)、扇头蜱属(*Rhipicephalus* spp.)、根嗜螨属(*Rhizoglyphus* spp.)、疥螨属(*Sarcoptes* spp.)、狭跗线螨属(*Steneotarsonemus* spp.)、跗线属(*Tarsonemus* spp.)以及叶螨属(*Tetranychus* spp.);

[0299] 来自虱目,例如

[0300] 血虱属(*Haematopinus* spp.)、长颚虱属(*Linognathus* spp.)、人虱(*Pediculus* spp.)、天疱疮属(*Pemphigus* spp.)以及木虱(*Phylloxera* spp.);

[0301] 来自鞘翅目,例如

[0302] 缺隆叩甲属(*Agriotes* spp.)、欧洲鳃角金龟(*Amphimallon majale*)、东方异丽金龟(*Anomala orientalis*)、花象属(*Anthonomus* spp.)、蜉金龟属(*Aphodius* spp.)、玉米拟花萤(*Astylus atromaculatus*)、*Ataenius*属、甜菜隐食甲(*Atomaria linearis*)、甜菜胫跳甲(*Chaetocnema tibialis*)、萤叶甲属(*Cerotoma* spp.)、单叶叩甲属(*Conoderus* spp.)、根颈象属(*Cosmopolites* spp.)、绿金龟(*Cotinis nitida*)、象虫属(*Curculio* spp.)、圆头犀金龟属(*Cyclocephala* spp.)、圆头犀金龟属(*Dermestes* spp.)、根萤叶甲属(*Diabrotica* spp.)、阿根廷兜虫(*Diloboderus abderus*)、食植瓢虫属(*Epilachna* spp.)、*Eremnus*属、黑异爪蔗金龟(*Heteronychus arator*)、咖啡果小蠹(*Hypothenemus hampei*)、*Lagria vilosa*、马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata*)、稻水象属(*Lissorhoptrus* spp.)、*Liogenys*属、*Maecolaspis*属、栗色绒金龟(*Maladera castanea*)、美洲叶甲亚种

(*Megascelis* spp)、油菜花露尾甲(*Melighetes aeneus*)、金龟属(*Melolontha* spp.)、*Myochrous armatus*、锯谷盗属(*Oryzaephilus* spp.)、耳喙象属(*Otiorhynchus* spp.)、鳃角金龟属(*Phyllophaga* spp.)、斑象属(*Phlyctinus* spp.)、丽金龟属(*Popillia* spp.)、油菜跳甲属(*Psylliodes* spp.)、*Rhysomatus aubtilis*、劫根蠹属(*Rhizopertha* spp.)、金龟子科(*Scarabeidae*)、米象属(*Sitophilus* spp.)、麦蛾属(*Sitotroga* spp.)、伪切根虫属(*Somaticus* spp.)、*Sphenophorus*属、大豆茎象(*Sternechus subsignatus*)、拟步行虫属(*Tenebrio* spp.)、拟谷盗属(*Tribolium* spp.)以及斑皮蠹属(*Trogoderma* spp.)；

[0303] 来自双翅目,例如

[0304] 伊蚊属(*Aedes* spp.)、疟蚊属(*Anopheles* spp.)、高粱芒蝇(*Antherigona soccata.*)、橄榄果实蝇(*Bactrocea oleae*)、花园毛蚊(*Bibio hortulanus*)、迟眼蕈蚊属(*Bradysia* spp.)、红头丽蝇(*Calliphora erythrocephala*)、小条实蝇属(*Ceratitis* spp.)、金蝇属(*Chrysomya* spp.)、库蚊属(*Culex* spp.)、黄蝇属(*Cuterebra* spp.)、寡鬃实蝇属(*Dacus* spp.)、地种蝇属(*Delia* spp.)、黑腹果蝇(*Drosophila melanogaster*)、厕蝇属(*Fannia* spp.)、胃蝇属(*Gastrophilus* spp.)、*Geomyza tripunctata*、舌蝇属(*Glossina* spp.)、皮蝇属(*Hypoderma* spp.)、虱蝇属(*Hyppobosca* spp.)、斑潜蝇属(*Liriomyza* spp.)、绿蝇属(*Lucilia* spp.)、潜蝇属(*Melanagromyza* spp.)、家蝇属(*Musca* spp.)、狂蝇属(*Oestrus* spp.)、瘿蚊属(*Orseolia* spp.)、瑞典麦秆蝇(*Oscinella frit*)、藜泉蝇(*Pegomyia hyoscyami*)、草种蝇属(*Phorbia* spp.)、绕实蝇属(*Rhagoletis* spp.)、*Rivelia quadrifasciata*、*Scatella*属、蕈蚊属(*Sciara* spp.)、刺蝇属(*Stomoxys* spp.)、虻属(*Tabanus* spp.)、绦虫属(*Tannia* spp.)以及大蚊属(*Tipula* spp.)；

[0305] 来自半翅目,例如

[0306] 瘤缘蝽(*Acanthocoris scabrator*)、绿蝽属、苜蓿盲蝽、*Amblypeltanitida*、海虾盾缘蝽(*Bathycoelia thalassina*)、土长蝽属、臭虫属、*Clavigralla tomentosicollis*、盲蝽属(*Creontiades* spp.)、可可瘤盲蝽、*Dichelops furcatus*、棉红蝽属、*Edessa*属、美洲蝽属(*Euchistus* spp.)、六斑菜蝽(*Eurydema pulchrum*)、扁盾蝽属、茶翅蝽、具凹巨股长蝽(*Horciasnobilellus*)、稻缘蝽属、草盲蝽属、热带硕蚱属、卷心菜斑色蝽(*Murgantia histrionic*)、*Neomegalotomus*属、烟盲蝽(*Nesidiocoris tenuis*)、绿蝽属、拟长蝽(*Nysius simulans*)、*Oebalus insularis*、皮蝽属、壁蝽属、红猎蝽属、可可盲蝽象、*Scaptocoris castanea*、黑蝽属(*Scotinophara* spp.)、*Thyanta*属、锥鼻虫属、木薯网蝽(*Vatiga illudens*)；

[0307] 无网长管蚜属、*Adalges*属、*Agalliana ensigera*、*Agonosцена targionii*、粉虱属(*Aleurodicus* spp.)、刺粉虱属(*Aleurocanthus* spp.)、甘蔗穴粉虱、软毛粉虱(*Aleurothrixus floccosus*)、甘蓝粉虱(*Aleyrodes brassicae*)、棉叶蝉(*Amarasca biguttula*)、*Amritodus atkinson*、肾圆盾蚱属、蚜科、蚜属、蚱属(*Aspidiotus* spp.)、茄沟无网蚜、*Bactericera cockerelli*、小粉虱属、短尾蚜属(*Brachycaudus* spp.)、甘蓝蚜、喀木虱属、双尾蚜(*Cavariella aegopodii* Scop.)、蜡蚱属、褐圆蚱、网籽草叶圆蚱、*Cicadella*属、大白叶蝉(*Cofana spectra*)、隐瘤蚜属、*Cicadulina*属、褐软蚱、玉米黄翅叶蝉、裸粉虱属、柑橘木虱、麦双尾蚜、西圆尾蚜属、小绿叶蝉属、苹果绵蚜、葡萄斑叶蝉属、蜡蚱属、赤桉木虱(*Glycaspis brimblecombei*)、菜缢管蚜、大尾蚜属(*Hyalopterus* spp.)、超



瘤蚜种、檬果绿叶蝉 (*Idioscopus clypealis*)、*Jacobiasca lybica*、灰飞虱属、球坚蚧、蛎盾蚧属、萝卜蚜 (*Lopaphis erysimi*)、*Lyogenys maidis*、长管蚜属、*Mahanarva* 属、蛾蜡蝉科 (*Metcalfa pruinosa*)、麦无网蚜、*Myndus crudus*、瘤蚜属、台湾韭蚜、黑尾叶蝉属、褐飞虱属 (*Nilaparvata* spp.)、梨大绿蚜、*Odonaspis ruthae*、寄生甘蔗绵蚜、杨梅缘粉虱、考氏木虱、片盾蚧属、瘿绵蚜属、玉米蜡蝉、扁角飞虱属、忽布疣蚜、根瘤蚜属、动性球菌属、白盾蚧属、粉蚧属、棉盲蝽 (*Pseudatomoscelis seriatus*)、木虱属、棉蚧 (*Pulvinaria aethiopica*)、笠圆盾蚧属、*Quesada gigas*、电光叶蝉 (*Recilia dorsalis*)、缢管蚜属、黑盔蚧属、带叶蝉属、二叉蚜属、麦蚜属 (*Sitobion* spp.)、白背飞虱、苜蓿膜翅角蝉 (*Spissistilus festinus*)、条斑飞虱 (*Tarophagus Proserpina*)、声蚜属、粉虱属、*Tridiscus sporoboli*、葵粉蚧属 (*Trionymus* spp.)、非洲木虱、桔矢尖蚧、*Zygina flammigera*、*Zyginidia scutellaris*;

[0308] 来自膜翅目, 例如

[0309] 顶切叶蚁属 (*Acromyrmex*)、三节叶蜂属 (*Arge* spp.)、布切叶白蚁属 (*Atta* spp.)、茎叶蜂属 (*Cephus* spp.)、松叶蜂属 (*Diprion* spp.)、锯角叶蜂科 (*Diprionidae*)、松叶蜂 (*Gilpinia polytoma*)、梨实蜂属 (*Hoplocampa* spp.)、毛蚁属 (*Lasius* spp.)、小黄家蚁 (*Monomorium pharaonis*)、新松叶蜂属 (*Neodiprion* spp.)、农蚁属 (*Pogonomyrmex* spp.)、*Slenopsis invicta*、水蚁属 (*Solenopsis* spp.) 以及胡蜂属 (*Vespa* spp.);

[0310] 来自等翅目, 例如

[0311] 家白蚁属 (*Coptotermes* spp.)、白蚁 (*Cornitermes cumulans*)、楹白蚁属 (*Incisitermes* spp.)、大白蚁属 (*Macrotermes* spp.)、澳白蚁属 (*Mastotermes* spp.)、小白蚁属 (*Microtermes* spp.)、散白蚁属 (*Reticulitermes* spp.); 热带火蚁 (*Solenopsis geminate*)

[0312] 来自鳞翅目 (*Lepidoptera*), 例如,

[0313] 长翅卷蛾属、褐带卷蛾属、透翅蛾属、地夜蛾属、棉叶虫、*Amylois* 属、黎豆夜蛾、黄卷蛾属、银蛾属 (*Argyresthia* spp.)、带卷蛾属、丫纹夜蛾属、棉潜蛾、玉米楷夜蛾、粉斑螟蛾、桃蛀果蛾、禾草螟属、卷叶蛾属、越蔓桔草螟 (*Chrysoteuchia topiaria*)、葡萄果蠹蛾、卷叶螟属、云卷蛾属、纹卷蛾属、鞘蛾属、鳞翅目粉蝶、*Cosmophila flava*、草螟属、大菜螟、苹果异形小卷蛾、黄杨木蛾、小卷蛾属、黄杨绢野螟、杆草螟属、苏丹棉铃虫、金刚钻属、非洲茎螟、粉螟属、叶小卷蛾属 (*Epinotia* spp.)、细斑灯蛾、*Etiella zinckinella*、花小卷蛾属、环针单纹蛾、黄毒蛾属、切根虫属、*Feltia jaculiferia*、小食心虫属 (*Grapholita* spp.)、绿青虫蛾、实夜蛾属、菜螟、切叶野螟属 (*Herpetogramma* spp.)、美国白蛾、番茄蠹蛾、*Lasmopalpus lignosellus*、旋纹潜叶蛾、潜叶细蛾属、葡萄花翅小卷蛾、*Loxostege bifidalis*、毒蛾属、潜蛾属、幕枯叶蛾属、甘蓝夜蛾、烟草天蛾、光腹夜蛾属 (*Mythimna* spp.)、夜蛾属、秋尺蛾属、*Orniodes indica*、欧洲玉米螟、超小卷蛾属、褐卷蛾属、小眼夜蛾、蛀茎夜蛾、*Pectinophora gossypiella*、咖啡潜叶蛾、一星黏虫、马铃薯麦蛾、菜粉蝶、粉蝶属、小菜蛾、芽蛾属、尺叶蛾属、薄荷灰夜蛾、西方豆地香 (*Richia albicosta*)、白禾螟属 (*Scirpophaga* spp.)、蛀茎夜蛾属、长须卷蛾属、灰翅夜蛾属、棉大卷叶螟、兴透翅蛾属、异舟蛾属、卷叶蛾属、粉纹夜蛾、番茄斑潜蝇、以及巢蛾属;

[0314] 来自食毛目 (*Mallophaga*), 例如,

[0315] 畜虱属(*Damalinea* spp.)和啮毛虱属(*Trichodectes* spp.);

[0316] 来自直翅目(Orthoptera),例如,

[0317] 蠊属(*Blatta* spp.)、小蠊属(*Blattella* spp.)、蝼蛄属(*Gryllotalpa* spp.)、马德拉蜚蠊(*Leucophaea maderae*)、飞蝗属(*Locusta* spp.)、北痣蟋蟀(*Neocurtilla hexadactyla*)、大蠊属(*Periplaneta* spp.)、痣蟋蟀属(*Scapteriscus* spp.)、以及沙漠蝗属(*Schistocerca* spp.);

[0318] 来自啮虫目(Psocoptera),例如,

[0319] 虱啮属(*Liposcelis* spp.);

[0320] 来自蚤目(Siphonaptera),例如,

[0321] 角叶蚤属(*Ceratophyllus* spp.)、栉头蚤属(*Ctenocephalides* spp.)以及开皇客蚤(*Xenopsylla cheopis*);

[0322] 来自缨翅目(Thysanoptera),例如,

[0323] *Calliothrips phaseoli*、花蓟马属(*Frankliniella* spp.)、阳蓟马属(*Heliothrips* spp.)、褐带蓟马属(*Hercinothrips* spp.)、单亲蓟马属(*Parthenothrips* spp.)、非洲桔硬蓟马(*Scirtothrips aurantii*)、大豆蓟马(*Sericothrips variabilis*)、带蓟马属(*Taeniothrips* spp.)、蓟马属(*Thrips* spp.);

[0324] 来自缨尾目(Thysanura),例如,衣鱼(*Lepisma saccharina*)。

[0325] 根据本发明的活性成分可用于控制、也就是遏制或破坏上述类型的有害生物,这些有害生物特别出现在植物上,尤其是在农业中、在园艺中以及在林业中的有用的植物和观赏植物上,或者在这些植物的器官上,例如果实、花、叶、茎、块茎或根,并且在一些情况下,甚至在一个随后的时间点形成的植物器官仍保持受保护以抵抗这些有害生物。

[0326] 特别地,适宜的目标作物是,谷物,如小麦、大麦、黑麦、燕麦、稻、玉米或高粱;甜菜,如糖用甜菜或饲料甜菜;水果,例如梨果、核果或无核小果,如苹果、梨、李子、桃、杏、樱桃或浆果,例如草莓、覆盆子或黑莓;豆科作物,如菜豆、小扁豆、豌豆或大豆;油料作物,如油菜、芥菜、罂粟、橄榄、向日葵、椰子、蓖麻、可可豆或落花生;瓜类作物,如南瓜、黄瓜或甜瓜;纤维植物,如棉花、亚麻、大麻或黄麻;柑橘类水果,如橙子、柠檬、葡萄柚或橘子;蔬菜,如菠菜、莴苣、芦笋、卷心菜、胡萝卜、洋葱、番茄、马铃薯或灯笼椒;樟科,如鳄梨、肉桂或樟脑;以及还有烟草、坚果、咖啡、茄子、甘蔗、茶、胡椒、葡萄藤、蛇麻草、车前草科以及乳胶植物。

[0327] 本发明的组合物和/或方法还可以用在任何观赏植物和/或蔬菜作物(包括花、灌木、阔叶树和常绿植物)上。

[0328] 例如,本发明可以用于任何以下观赏植物物种:藿香蓟属、假面花属(*Alonsoa* spp.)、银莲花属、南非葵、春黄菊属、金鱼草属、紫菀属、秋海棠属(例如丽格海棠、四季秋海棠、球根秋海棠(*B. tubéreux*))、叶子花属、雁河菊属(*Brachycome* spp.)、芸苔属(观赏植物)、蒲包草属、辣椒、长春花、美人蕉属、矢车菊属、菊属、瓜叶菊属(银叶菊)、金鸡菊属、青锁龙(*Crassula coccinea*)、火红萼距花(*Cuphea ignea*)、大丽花属、翠雀属、荷包牡丹、彩虹菊属(*Dorotheantus* spp.)、洋桔梗、连翘属、倒挂金钟属、鼠曲草老鹳草(*Geranium gnaphalium*)、大丁草属、千日红、天芥菜属、向日葵属、木槿属、绣球花属、绣球属、嫣红蔓、凤仙花属(非洲凤仙花)、血苋属(*Iresines* spp.)、伽蓝菜属、马缨丹、三月花葵、狮耳花、百

合属、日中花属、沟酸浆属、美国薄荷属、龙面花属、万寿菊属、石竹属(康乃馨)、美人蕉属、酢浆草属、雏菊属、天竺葵属(盾叶天竺葵、马蹄纹天竺葵)、莖菜属(三色莖)、碧冬茄属、草夹竹桃属、香茶菜属(*Plecthranthus* spp.)、一品红属、爬山虎属(五叶爬山虎、爬山虎)、报春花属、毛茛属、杜鹃花属、蔷薇属(玫瑰)、黄雏菊属、非洲莖属、鼠尾草属、紫扇花(*Scaevola aemola*)、蛾蝶花(*Schizanthus wisetonensis*)、景天属、茄属、苏非尼亚矮牵牛属(*Surfinia* spp.)、万寿菊属、烟草属、马鞭草属、百日草属以及其他花坛植物。

[0329] 例如,本发明可以用于任何以下蔬菜物种:葱属(大蒜、洋葱、火葱(*A. oschaninii*))、韭葱、小葱、大葱)、有喙欧芹、旱芹、芦笋、甜菜、芸苔属(甘蓝、大白菜、芜菁)、辣椒、鹰嘴豆、苦苣、菊苣属(菊苣、苦苣)、西瓜、黄瓜属(黄瓜、甜瓜)、南瓜属(西葫芦、印度南瓜)、菜蓟属(朝鲜蓟、刺苞菜蓟)、胡萝卜、茴香、金丝桃属、莴苣、番茄属(番茄、樱桃番茄)、薄荷属、罗勒、香芹、菜豆属(菜豆、荷包豆)、豌豆、萝卜、食用大黄、迷迭香属、鼠尾草属、黑婆罗门参、茄子、菠菜、新缬草属(莴苣缬草、*V. eriocarpa*)以及蚕豆。

[0330] 优选的观赏植物物种包括非洲莖(African violet)、秋海棠属、大丽花属、大丁草属、绣球属、马鞭草属、蔷薇属、伽蓝菜属、一品红属、紫菀属、矢车菊属、金鸡菊属、翠雀属、美国薄荷属、草夹竹桃属、黄雏菊属、景天属、碧冬茄属、莖菜属、凤仙花属、老鹳草属、菊属、毛茛属、倒挂金钟属、鼠尾草属、绣球花属、迷迭香、鼠尾草、圣约翰草(*St. Johnswort*)、薄荷(mint)、甜椒(sweet pepper)、番茄和黄瓜(cucumber)。

[0331] 根据本发明的这些活性成分尤其适合于控制棉花、蔬菜、玉米、水稻以及大豆作物上的扁豆蚜、黄瓜条叶甲、烟芽夜蛾、桃蚜、小菜蛾以及海灰翅夜蛾。根据本发明的这些活性成分另外尤其适合于控制甘蓝夜蛾(优选地在蔬菜上)、苹果蠹蛾(优选地在苹果上)、小绿叶蝉(优选地在蔬菜、葡萄园里)、马铃薯叶甲(优选地在马铃薯上)以及二化螟(优选地在水稻上)。

[0332] 在另一方面中,本发明还可涉及一种控制由植物寄生线虫(内寄生的-、半内寄生的-和外寄生线虫)对植物及其部分的损害的方法,尤其是以下植物寄生线虫,如根结线虫(root knot nematodes)、北方根结线虫(*Meloidogyne hapla*)、南方根结线虫(*Meloidogyne incognita*)、爪哇根结线虫(*Meloidogyne javanica*)、花生根结线虫(*Meloidogyne arenaria*)以及其他根结线虫物种;孢囊形成线虫(cyst-forming nematodes)、马铃薯金线虫(*Globodera rostochiensis*)以及其他球孢囊线虫属(*Globodera*)物种;禾谷孢囊线虫(*Heterodera avenae*)、大豆孢囊线虫(*Heterodera glycines*)、甜菜孢囊线虫(*Heterodera schachtii*)、红三叶异皮线虫(*Heterodera trifolii*)、以及其他异皮线虫属(*Heterodera*)物种;种瘿线虫(Seed gall nematodes)、粒线虫属(*Anguina*)物种;茎及叶面线虫(Stem and foliar nematodes)、滑刃线虫属(*Aphelenchoides*)物种;刺毛线虫(Sting nematodes)、长尾刺线虫(*Belonolaimus longicaudatus*)以及其他刺线虫属(*Belonolaimus*)物种;松树线虫(Pine nematodes)、松材线虫(*Bursaphelenchus xylophilus*)以及其他伞滑刃属(*Bursaphelenchus*)物种;环形线虫(Ring nematodes)、环线虫属(*Criconema*)物种、小环线虫属(*Criconemella*)物种、轮线虫属(*Criconemoides*)物种、中环线虫属(*Mesocriconema*)物种;茎及鳞球茎线虫(Stem and bulb nematodes)、腐烂茎线虫(*Ditylenchus destructor*)、鳞球茎茎线虫(*Ditylenchus dipsaci*)以及其他茎线虫属(*Ditylenchus*)物种;维线虫(Awl nematodes)、

锥线虫属 (*Dolichodorus*) 物种;螺旋线虫 (*Spiral nematodes*)、多头螺旋线虫 (*Helicotylenchus multicinctus*) 以及其他螺旋线虫属 (*Helicotylenchus*) 物种;鞘及鞘形线虫 (*Sheath and sheathoid nematodes*)、鞘线虫属 (*Hemicycliophora*) 物种以及半轮线虫属 (*Hemicriconemoides*) 物种;潜根线虫属 (*Hirshmanniella*) 物种;支线虫 (*Lance nematodes*)、冠线虫属 (*Hoploaimus*) 物种;假根结线虫 (*false rootknot nematodes*)、珍珠线虫属 (*Nacobbus*) 物种;针状线虫 (*Needle nematodes*)、横带长针线虫 (*Longidorus elongatus*) 以及其他长针线虫属 (*Longidorus*) 物种;大头针线虫 (*Pin nematodes*)、短体线虫属 (*Pratylenchus*) 物种;腐线虫 (*Lesion nematodes*)、花斑短体线虫 (*Pratylenchus neglectus*)、穿刺短体线虫 (*Pratylenchus penetrans*)、弯曲短体线虫 (*Pratylenchus curvatus*)、古氏短体线虫 (*Pratylenchus goodeyi*) 以及其他短体线虫属物种;柑桔穿孔线虫 (*Burrowing nematodes*)、香蕉穿孔线虫 (*Radopholus similis*) 以及其他内侵线虫属 (*Radopholus*) 物种;肾状线虫 (*Reniform nematodes*)、罗柏氏盘旋线虫 (*Rotylenchus robustus*)、肾形盘旋线虫 (*Rotylenchus reniformis*) 以及其他盘旋线虫属 (*Rotylenchus*) 物种;盾线虫属 (*Scutellonema*) 物种;短粗根线虫 (*Stubby root nematodes*)、原始毛刺线虫 (*Trichodorus primitivus*) 以及其他毛刺线虫属 (*Trichodorus*) 物种、拟毛刺线虫属 (*Paratrichodorus*) 物种;矮化线虫 (*Stunt nematodes*)、马齿苋矮化线虫 (*Tylenchorhynchus claytoni*)、顺逆矮化线虫 (*Tylenchorhynchus dubius*) 以及其他矮化线虫属 (*Tylenchorhynchus*) 物种;柑桔线虫 (*Citrus nematodes*)、穿刺线虫 (*Tylenchulus*) 物种;短剑线虫 (*Dagger nematodes*)、剑线虫属 (*Xiphinema*) 物种;以及其他植物寄生线虫物种,如亚粒线虫属 (*Subanguina* spp.)、根结线虫属 (*Hypsoperine* spp.)、大刺环线虫属 (*Macroposthonia* spp.)、矮化线虫属 (*Melinius* spp.)、刻点胞囊属 (*Punctodera* spp.)、以及五沟线虫属 (*Quinisulcius* spp.)。

[0333] 本发明所述的化合物还具有针对软体动物的活性。其实例包括例如福寿螺科;蛞蝓科 (*Arion*) (黑蛞蝓 (*A. ater*)、环状蛞蝓 (*A. circumscriptus*)、棕阿勇蛞蝓 (*A. hortensis*)、红蛞蝓 (*A. rufus*));巴蜗牛科 (*Bradybaenidae*) (灌木巴蜗牛 (*Bradybaena fruticum*));葱蜗牛属 (*Cepaea*) (花园葱蜗牛 (*C. hortensis*)、森林葱蜗牛 (*C. Nemoralis*));*ochlodina*;野蛞蝓属 (*Deroceras*) (野灰蛞蝓 (*D. agrestis*)、*D. empiricorum*、光滑野蛞蝓 (*D. laeve*)、网纹野蛞蝓 (*D. reticulatum*));圆盘螺属 (*Discus*) (圆形圆盘蜗牛 (*D. rotundatus*));*Euomphalia*;土蜗属 (*Galba*) (截口土蜗 (*G. trunculata*));小蜗牛属 (*Helicelia*) (伊塔拉小蜗牛 (*H. itala*)、布维小蜗牛 (*H. obvia*));大蜗牛科 (*Helicidae*) (*Helicigona arbustorum*);*Helicodiscus*;大蜗牛 (*Helix*) (开口大蜗牛 (*H. aperta*));蛞蝓属 (*Limax*) (利迈科斯蛞蝓 (*L. cinereoniger*)、黄蛞蝓 (*L. flavus*)、边缘蛞蝓 (*L. marginatus*)、大蛞蝓 (*L. maximus*)、柔蛞蝓 (*L. tenellus*));椎实螺属 (*Lymnaea*);*Milax* (小蛞蝓科) (黑色小蛞蝓 (*M. gagates*)、边缘小蛞蝓 (*M. marginatus*)、硕氏小蛞蝓 (*M. sowerbyi*));钻螺属 (*Opeas*);瓶螺属 (*Pomacea*) (福寿螺 (*P. canaticulata*));瓦娄蜗牛属 (*Vallonia*) 和 *Zanitoides*。

[0334] 术语“作物”应当理解为还包括已经通过使用重组DNA技术而被这样转化使其能够合成一种或多种选择性作用毒素的作物植物,这些毒素是如已知例如来自于产毒素细菌,尤其是芽孢杆菌属的那些细菌。

[0335] 可由此类转基因植物表达的毒素包括例如杀昆虫蛋白,例如来自蜡样芽孢杆菌或日本金龟子芽孢杆菌的杀昆虫蛋白;或者来自苏云金芽孢杆菌的杀昆虫蛋白,如 $\delta$ -内毒素,例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C,或者营养期杀昆虫蛋白(Vip),例如Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A;或细菌定植线虫的杀昆虫蛋白,例如光杆杆菌属某些种(*Photorhabdus* spp.)或致病杆菌属某些种(*Xenorhabdus* spp.),如发光杆菌(*Photorhabdus luminescens*)、嗜线虫致病杆菌(*Xenorhabdus nematophilus*);由动物产生的毒素,如蝎毒素、蛛毒素、蜂毒素和其他昆虫特异性神经毒素;由真菌产生的毒素,如链霉菌毒素,植物凝集素类(lectin),如豌豆凝集素、大麦凝集素或雪花莲凝集素;凝集素类(agglutinin);蛋白酶抑制剂,如胰蛋白酶抑制剂、丝蛋白酶抑制剂、马铃薯糖蛋白、胰毒素、木瓜蛋白酶抑制剂;核糖体失活蛋白(RIP),如蓖麻毒素、玉米-RIP、相思豆毒素、丝瓜籽蛋白、皂草素或异株泻根毒蛋白;类固醇代谢酶,如3-羟基类固醇氧化酶、蜕化类固醇-UDP-糖基-转移酶、胆固醇氧化酶、蜕化素抑制剂、HMG-COA-还原酶、离子通道阻断剂如钠通道或钙通道阻断剂、保幼激素酯酶、利尿激素受体、芪合酶、联苳合酶、几丁质酶和葡聚糖酶。

[0336] 在本发明的上下文中, $\delta$ -内毒素(例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C)或营养期杀虫蛋白(Vip)(例如Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A)应理解为显然还包括混合型毒素、截短的毒素和经修饰的毒素。混合型毒素是通过那些蛋白的不同结构域的新组合重组产生的(参见例如,WO 02/15701)。截短的毒素,例如截短的Cry1Ab是已知的。在经修饰的毒素的情况下,天然存在的毒素的一个或多个氨基酸被置换。在此类氨基酸置换中,优选将非天然存在的蛋白酶识别序列插入毒素中,例如像在Cry3A055的情况下,组织蛋白酶-G-识别序列被插入Cry3A毒素中(参见WO 03/018810)。

[0337] 此类毒素或能够合成此类毒素的转基因植物的实例披露于例如EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451 878以及WO 03/052073中。

[0338] 用于制备此类转基因植物的方法通常是本领域技术人员已知的并且描述在例如以上提及的公开物中。CryI型脱氧核糖核酸及其制备例如从WO 95/34656、EP-A-0 367 474、EP-A-0 401 979和WO 90/13651中已知。

[0339] 包含在转基因植物中的毒素使得植物对有害昆虫有耐受性。这样的昆虫可以存在于任何昆虫分类群,但尤其常见于甲虫(鞘翅目)、双翅昆虫(双翅目)和蛾(鳞翅目)。

[0340] 含有一种或多种编码杀昆虫剂抗性并且表达一种或多种毒素的基因的转基因植物是已知的并且其中一些是可商购的。此类植物的实例是:**YieldGard®**(玉米品种,表达Cry1Ab毒素);**YieldGard Rootworm®**(玉米品种,表达Cry3Bb1毒素);**YieldGard Plus®**(玉米品种,表达Cry1Ab和Cry3Bb1毒素);**Starlink®**(玉米品种,表达Cry9C毒素);**Herculex I®**(玉米品种,表达Cry1Fa2毒素和获得对除草剂草铵膦的耐受性的酶膦丝菌素N-乙酰基转移酶(PAT));**NuCOTN 33B®**(棉花品种,表达Cry1Ac毒素);**Bollgard I®**(棉花品种,表达Cry1Ac毒素);**Bollgard II®**(棉花品种,表达Cry1Ac和Cry2Ab毒素);**VipCot®**(棉花品种,表达Vip3A和Cry1Ab毒素);**NewLeaf®**(马铃薯品种,表达Cry3A毒素);**NatureGard®**、**Agrisure®** GT Advantage (GA21耐草甘膦性状)、**Agrisure®** CB Advantage (Bt11玉米螟(CB)性状)以及**Protecta®**。

[0341] 此类转基因作物的另外的实例是：

[0342] 1. Bt11玉米，来自先正达种子子公司 (Syngenta Seeds SAS)，霍比特路 (Chemin de l'Hobit) 27, F-31 790 圣苏维尔 (St. Sauveur)，法国，登记号 C/FR/96/05/10。遗传修饰的玉蜀黍，已经通过转基因表达截短的 Cry1Ab 毒素，使之能抵抗欧洲玉米螟 (玉米螟和粉茎螟) 的侵袭。Bt11 玉米还转基因表达 PAT 酶以获得对除草剂草铵膦的耐受性。

[0343] 2. Bt176 玉米，来自先正达种子子公司，霍比特路 27, F-31 790 圣苏维尔，法国，登记号 C/FR/96/05/10。遗传修饰的玉蜀黍，通过转基因表达 Cry1Ab 毒素，使之能抵抗欧洲玉米螟 (玉米螟和粉茎螟) 的侵袭。Bt176 玉米还转基因表达酶 PAT 以获得对除草剂草铵膦的耐受性。

[0344] 3. MIR604 玉米，来自先正达种子子公司，霍比特路 27, F-31 790 圣苏维尔，法国，登记号 C/FR/96/05/10。通过转基因表达经修饰的 Cry3A 毒素使之具有昆虫抗性的玉米。该毒素是通过插入组织蛋白酶-G-蛋白酶识别序列而经修饰的 Cry3A055。此类转基因玉米植物的制备描述于 WO 03/018810 中。

[0345] 4. MON 863 玉米，来自孟山都欧洲公司 (Monsanto Europe S.A.)，270-272 特弗伦大道 (Avenue de Tervuren)，B-1150 布鲁塞尔，比利时，登记号 C/DE/02/9。MON 863 表达 Cry3Bb1 毒素，并且对某些鞘翅目昆虫有抗性。

[0346] 5. IPC 531 棉花，来自孟山都欧洲公司 (Monsanto Europe S.A.)，270-272 特弗伦大道 (Avenue de Tervuren)，B-1150 布鲁塞尔，比利时，登记号 C/ES/96/02。

[0347] 6. 1507 玉米，来自先锋海外公司 (Pioneer Overseas Corporation)，特德斯科大 道 (Avenue Tedesco)，7B-1160 布鲁塞尔，比利时，登记号 C/NL/00/10。遗传修饰的玉米，表 达蛋白质 Cry1F 以获得对某些鳞翅目昆虫的抗性，并且表达 PAT 蛋白质以获得对除草剂草 铵膦的耐受性。

[0348] 7. NK603×MON 810 玉米，来自孟山都欧洲公司 (Monsanto Europe S.A.)，270-272 特弗伦大道 (Avenue de Tervuren)，B-1150 布鲁塞尔，比利时，登记号 C/GB/02/M3/03。通过 将遗传修饰的品种 NK603 和 MON 810 杂交，由常规育种的杂交玉米品种构成。NK603×MON 810 玉米转基因地表达由土壤杆菌属菌株 CP4 获得的蛋白质 CP4 EPSPS，使之耐除草剂 **Roundup®** (含有草甘膦)，以及还有由苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种获得的 Cry1Ab 毒素，使之耐某些鳞翅目昆虫，包括欧洲玉米螟。

[0349] 抗昆虫的植物的转基因作物还描述于 BATS (生物安全与可持续发展中心 (Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit)，BATS 中心 (Zentrum BATS)，克拉斯崔舍 (Clarastrasse) 13，巴塞尔 (Basel) 4058，瑞士) 报告 2003 (<http://bats.ch>) 中。

[0350] 术语“作物”应理解为还包括已经通过使用重组 DNA 技术而被这样转化使其能够合 成具有选择性作用的抗病原物质的作物植物，这些抗病原物质是例如像所谓的“病程相关 蛋白” (PRP，参见例如 EP-A-0 392 225)。这样的抗病原物质和能够合成这样的抗病原物质 的转基因植物的实例例如从 EP-A-0 392 225、WO 95/33818 和 EP-A-0 353 191 是已知的。生 产这样的转基因植物的方法对于本领域的技术人员而言通常是已知的并且描述于例如以 上提及的公开物中。

[0351] 可由此类转基因植物表达的抗病原物质包括例如离子通道阻断剂，如钠通道和钙 通道的阻断剂，例如病毒 KP1、KP4 或 KP6 毒素；芪合酶；联苄合酶；几丁质酶；葡聚糖酶；所谓

“病程相关蛋白”(PRP;参见例如EP-A-0 392 225);由微生物产生的抗病原物质,例如肽抗生素或杂环抗生素(参见例如WO 95/33818)或参与植物病原体防御的蛋白质或多肽因子(所谓“植物疾病抗性基因”,如WO 03/000906中所述)。

[0352] 根据本发明的组合物的其他使用范围是保护所储存的物品和储存室以及保护原材料,如木材、纺织品、地板或建筑物,以及还在卫生领域中,尤其是保护人类、家畜以及多产的牲畜免遭所提及类型的有害生物的危害。

[0353] 本发明还提供了用于控制有害生物(如蚊和其他的疾病媒介物;同样参见[http://www.who.int/malaria/vector\\_control/irs/en/](http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/))的方法。在一个实施例中,用于控制有害生物的方法包括通过涂刷、轧制、喷雾、涂布或浸渍,向目标有害生物、它们的场所或表面或基质施用本发明的组合物。通过举例,通过本发明的方法考虑到了表面(诸如墙、天花板或地板表面)的IRS(室内滞留喷雾)施用。在另一个实施例中,考虑到了将此类组合物施用于如下基质,如无纺织物或织物材料,该材料处于网织品、被覆物、被褥、窗帘以及帐篷的形式(或可以用于在这些物品的制造中使用)。

[0354] 在一个实施例中,用于控制此类有害生物的方法包括向目标有害生物、它们的场所或表面或基质施用杀有害生物有效量的本发明的组合物,以便于在该表面或基质上提供有效的滞留的杀有害生物活性。这样的施用可以通过涂刷、轧制、喷雾、涂布或浸渍本发明的杀有害生物组合物来进行。通过举例,通过本发明的方法考虑到了表面(如墙、天花板或地板表面)的IRS施用,以便于在该表面上提供有效的滞留的杀有害生物活性。在另一个实施例中,考虑了施用这样的组合物以用于在基质上的有害生物的残留控制,该基质是如处于网织品、被覆物、被褥、窗帘以及帐篷的形式(或可以用于在这些物品的制造中)的织物材料。

[0355] 有待处理的基质(包括无纺物、织物或网织品)可以由天然纤维,如棉花、拉菲亚树叶纤维、黄麻、亚麻、剑麻、粗麻布或羊毛,或者合成纤维,诸如聚酰胺、聚酯、聚丙烯、聚丙烯腈等等制成。聚酯是特别适合的。纺织品处理的方法是已知的,例如WO 2008/151984、WO 2003/034823、US 5631072、WO 2005/64072、WO 2006/128870、EP 1724392、WO 2005113886或WO 2007/090739。

[0356] 根据本发明的组合物的其他使用范围是针对所有观赏树木连同所有种类的果树和坚果树的树木注射/树干处理领域。

[0357] 在树木注射/树干处理领域中,根据本发明的化合物尤其适合于对抗来自如上提及的鳞翅目和来自鞘翅目的蛀木昆虫,尤其是对抗下表A和B中列出的蛀木虫:

[0358] 表A. 具有经济重要性的外来蛀木虫的实例。

	科	种	受感染的宿主或作物
	吉丁虫科	白蜡窄吉丁	白蜡木 (Ash)
	天牛科	光肩天牛	硬木
[0359]	小蠹科	粗穗赖草足距小蠹 ( <i>Xylosandrus crassiusculus</i> )	硬木
		削尾材小蠹	硬木
		纵坑切梢小蠹	松柏类植物

[0360] 表B. 具有经济重要性的本地蛀木虫的实例。

	科	种	受感染的宿主或作物
[0361]	吉丁虫科	桦铜窄吉丁 ( <i>Agrilus anxius</i> )	桦树
		磨光窄吉丁 ( <i>Agrilus politus</i> )	柳树、枫树
		<i>Agrilus sayi</i>	杨梅、香蕨木



[0362]

科	种	受侵染的宿主或作物
	<i>Agrilus vittaticollis</i>	苹果树、梨树、蔓越橘、唐棣、山楂树
	苹扁头吉丁 ( <i>Chrysobothris femorata</i> )	苹果树、杏树、山毛榉、白蜡木、樱桃树、栗树、红醋栗树、榆树、山楂树、朴树、山核桃树、欧洲七叶树、菩提树、枫树、欧洲花楸树、橡树、美洲山核桃树、梨树、桃树、柿子树、李子树、杨树、温柏、美国紫荆、唐棣、美国梧桐、核桃树、柳树
	<i>Texania campestris</i>	椴木、山毛榉、枫树、橡树、美国梧桐、柳树、黄杨
天牛科	对山毛榉天牛 ( <i>Goes pulverulentus</i> )	山毛榉、榆树、纳托尔 (Nuttall)、柳树、黑橡树、樱皮镰状栎、黑栎、美国梧桐
	虎橡天牛 ( <i>Goes tigrinus</i> )	橡树
	黑腹尼虎天牛 ( <i>Neoclytus acuminatus</i> )	白蜡木、山核桃树、橡树、核桃树、桦树、山毛榉、枫树、美洲铁木 (Eastern hophornbeam)、山茱萸、柿子树、美国紫荆、冬青、朴树、洋槐、美国皂荚木 (Honeylocust)、黄杨、栗树、奥塞奇橙木 (Osage-orange)、黄樟、紫丁香、短叶紫杉

[0363]

科	种	受侵染的宿主或作物
		(Mountain-mahogany)、梨树、樱桃树、李子树、桃树、苹果树、榆树、菩提树、枫香
	三线无花果天牛 ( <i>Neoptychodes trilineatus</i> )	无花果树、赤杨木、桑树、柳树、网叶朴树 (Netleaf hackberry)
	灰翅筒天牛 ( <i>Oberea ocellata</i> )	漆树、苹果树、桃树、李子树、梨树、红醋栗树、黑莓
	三点筒天牛 ( <i>Oberea tripunctata</i> )	山茱萸、荚蒾属、榆树、酸模树、蓝莓、杜鹃花属、杜鹃、月桂树、杨树、柳树、桑树
	绕枝沟胫天牛 ( <i>Oncideres cingulata</i> )	山核桃树、美洲山核桃树、柿子树、榆树、酸模树、菩提树、美国皂荚木、山茱萸、桉树、橡树、朴树、枫树、果树
	对杨黄斑楔天牛 ( <i>Saperda calcarata</i> )	杨树
	<i>Strophiona nitens</i>	栗树、橡树、山核桃树、核桃树、山毛榉、枫树
小蠹科	<i>Corthylus columbianus</i>	枫树、橡树、黄杨、山毛榉、白蜡槭、美国梧桐、桦树、菩提树、栗树、榆树
	南方松大小蠹 ( <i>Dendroctonus frontalis</i> )	松树
	美桦毛小蠹 ( <i>Dryocoetes betulae</i> )	桦树、枫香、野樱桃树、山

科	种	受侵染的宿主或作物
		毛榉、梨树
	<i>黄带芳小蠹 (Monarthrum fasciatum)</i>	橡树、枫树、桦树、栗树、枫香、蓝果木、杨树、山核桃树、含羞草、苹果树、桃树、松树
	<i>桃鳃角小蠹 (Phloeotribus liminaris)</i>	桃树、樱桃树、李子树、黑樱桃树、榆树、桑树、欧洲花楸树
	<i>Pseudopityophthorus pruinus</i>	橡树、美国山毛榉木、黑樱桃树、契卡索李子树 (Chickasaw plum)、栗树、枫树、山核桃树、角树、铁木
[0364]	<i>栋透翅蛾 (Paranthrene simulans)</i>	橡树、美洲栗树
	<i>Sannina uroceriformis</i>	柿子树
	小桃翅蛾	桃树、李子树、油桃树、樱桃树、杏树、扁桃树、黑樱桃树
	<i>李桃翅蛾 (Synanthedon pictipes)</i>	桃树、李子树、樱桃树、山毛榉、黑樱桃树
透翅蛾科	<i>Synanthedon rubrofascia</i>	蓝果树
	<i>Synanthedon scitula</i>	山茱萸、美洲山核桃、山核桃树、橡树、栗树、山毛榉、桦树、黑樱桃树、榆树、欧洲花楸树、荚蒾属、柳树、苹果树、枇杷树、九层皮、杨梅
		受侵染的宿主或作物
[0365]	<i>葡萄根透翅蛾 (Vitacea polistiformis)</i>	葡萄树

[0366] 本发明也可以用于控制任何可以存在于草坪草中的昆虫有害生物,包括例如甲虫、毛虫、火蚁、地面珍珠(ground pearl)、千足虫、潮虫、螨虫、蜈蚣、介壳虫、粉蚧、沫蝉、南方麦小蝽以及蛴螬。本发明可以用于控制处于其生命周期的各个阶段的昆虫有害生物,包括卵、幼虫、若虫和成虫。

[0367] 具体而言,本发明可用于控制用草坪草的根部喂养的昆虫有害生物,该昆虫有害生物包括蛴螬(诸如圆头犀金龟属(*Cyclocephala* spp.) (例如标记的金龟子、*C.lurida*)、*Rhizotrogus*属(例如欧洲金龟子,欧洲切根鳃金龟(*R.majalis*))、黄栌属(例如绿六月甲虫(Green June beetle)、*C.nitida*)、弧丽金龟属(*Popillia* spp.) (例如日本甲虫、龟纹瓢虫(*P.japonica*))、鳃角金龟属(*Phyllophaga* spp.) (例如五月/六月甲虫)、*Ataenius*属(例如草坪草黑金龟(Black turfgrass ataenius)、*A.spretulus*)、绒毛金龟属(*Maladera* spp.) (例如亚洲花园甲虫(Asiatic garden beetle)、*M.castanea*)以及*Tomarus*属)、地面珍珠(硕蚧属(*Margarodes* spp.))、蜈蚣(褐黄色的、南方的、以及短翅的;痣蟋蟀属(*Scapteriscus* spp.))、非洲蜈蚣(*Grylotalpa africana*))以及大蚊幼虫(leatherjackets)(欧洲大蚊(European crane fly)、大蚊属(*Tipula* spp.))。

[0368] 本发明还可以用于控制茅草住宅的草坪草的昆虫有害生物,这些昆虫有害生物包括粘虫(诸如秋夜蛾(fall armyworm)草地贪夜蛾(*Spodoptera frugiperda*),和常见夜蛾一星黏虫(*Pseudaletia unipuncta*))、切根虫,象鼻虫(尖隐喙象属(*Sphenophorus* spp.)),诸如*S.venatus verstitus*和牧草长喙象(*S.parvulus*))以及草地螟(如草地螟属(*Crambus* spp.)和热带草地螟,*Herpetogramma phaeopteralis*)。

[0369] 本发明还可以用于控制在地上生活并取食草坪草叶子的草坪草中的昆虫有害生物,这些昆虫有害生物包括麦小蝽(如南方麦小蝽,南方杆长蝽(*Blissus insularis*))、狗牙根螨(Bermudagrass mite)(*Eriophyes cynodoniensis*)、盖氏虎尾草粉蚧(草竹粉蚧(*Antonina graminis*))、两线沫蝉(*Prospapia bicincta*)、叶蝉、切根虫(夜蛾科)、以及麦二叉蚜。

[0370] 本发明还可以用于控制草坪草中的其他有害生物,如在草坪中创建蚁巢的外引红火蚁(红火蚁(*Solenopsis invicta*))。

[0371] 在卫生领域中,根据本发明的组合物是有效地对抗外寄生虫诸如硬蜱、软蜱、疥螨、秋螨、蝇(叮咬和舔舐)、寄生性蝇幼虫,虱、发虱、鸟虱和跳蚤。

[0372] 此类寄生虫的实例是:

[0373] 虱目:血虱属、长腭虱属、人虱属以及阴虱属(*Phthirus* spp.)、管虱属。

[0374] 食毛目:毛羽虱属、短角鸟虱属、鸭虱属、牛羽虱属、*Werneckiella*属、*Lepikentron*属、畜虱属、啮毛虱属以及猫羽虱属(*Felicola* spp.)。

[0375] 双翅目及长角亚目(*Nematocera*)和短角亚目(*Brachycera*),例如伊蚊属、疟蚊属、库蚊属、蚋属(*Simulium* spp.)、真蚋属(*Eusimulium* spp.)、白蛉属(*Phlebotomus* spp.)、罗蛉属(*Lutzomyia* spp.)、库蠓属(*Culicoides* spp.)、斑虻属(*Chrysops* spp.)、驼背虻属(*Hybomitra* spp.)、黄虻属(*Atylotus* spp.)、虻属、麻虻属(*Haematopota* spp.)、*Philipomyia*属、蜂虻蝇属(*Braula* spp.)、家蝇属、齿股蝇属(*Hydrotaea* spp.)、螫蝇属、黑角蝇属(*Haematobia* spp.)、莫蝇属(*Morellia* spp.)、厕蝇属、舌蝇属、丽蝇属(*Calliphora* spp.)、绿蝇属、金蝇属、污蝇属(*Wohlfahrtia* spp.)、麻蝇属(*Sarcophaga* spp.)、狂蝇属、

皮蝇属、胃蝇属(*Gasterophilus* spp.)、虱蝇属(*Hippobosca* spp.)、羊虱蝇属(*Lipoptena* spp.)和蜚蝇属(*Melophagus* spp.)。

[0376] 蚤目(Siphonapterida),例如蚤属(*Pulex* spp.)、栉头蚤属、客蚤属(*Xenopsylla* spp.)、角叶蚤属。

[0377] 异翅目(Heteropterida),例如臭虫属、锥鼻虫属、红猎蝽属、锥蝽属(*Panstrongylus* spp.)。

[0378] 蜚蠊目(Blattarida),例如东方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、美洲大蠊(*Periplaneta americana*)、德国小蠊(*Blattella germanica*)以及夏柏拉蟑螂属(*Supella* spp.)。

[0379] 蜱螨(Acaria)亚纲(螨科(Acarida))和后气门目(Meta-stigmata)和中气门目(Meso-stigmata),例如锐缘蜱属、钝缘蜱属(*Ornithodoros* spp.)、耳蜱属(*Otobius* spp.)、硬蜱属、钝眼蜱属、牛蜱属(*Boophilus* spp.)、革蜱属(*Dermacentor* spp.)、血蜱属(*Haemophysalis* spp.)、璃眼蜱属、扇头蜱属、皮刺螨属(*Dermanyssus* spp.)、刺利螨属(*Raillietia* spp.)、肺刺螨属(*Pneumonyssus* spp.)、胸刺螨属(*Sternostoma* spp.)和瓦螨属(*Varroa* spp.)。

[0380] 轴螨目(Actinedida)(前气门亚目(Prostigmata))和粉螨目(Acaridida)(无气门亚目(Astigmata)),例如蜂盾螨属(*Acarapis* spp.)、姬螯属(*Cheyletiella* spp.)、禽螯螨属(*Ornithocheyletia* spp.)、肉螨属(*Myobia* spp.)、疮螨属(*Psorergates* spp.)、蠕形螨属(*Demodex* spp.)、恙螨属(*Trombicula* spp.)、牦螨属(*Listrophorus* spp.)、粉螨属(*Acarus* spp.)、食酪螨属(*Tyrophagus* spp.)、嗜木螨属(*Caloglyphus* spp.)、颈下螨属(*Hypodectes* spp.)、翅螨属(*Pterolichus* spp.)、痒螨属、皮螨属、耳疥螨属(*Otodectes* spp.)、疥螨属、耳螨属(*Notoedres* spp.)、鸟疥螨属(*Knemidocoptes* spp.)、胞螨属(*Cytodites* spp.)以及鸡雏螨属(*Laminosioptes* spp.)。

[0381] 根据本发明的组合物还适用于保护材料如木材、纺织品、塑料、粘合剂、胶、漆料、纸张和卡片、皮革、地板和建筑免受昆虫侵染。

[0382] 根据本发明的这些组合物可用于,例如,对抗下列有害生物:甲虫,如北美家天牛、多毛绿虎天牛、家具窃蠹、报死窃蠹、*Ptilinuspecticornis*、*Dendrobium pertinex*、细齿叉尾长蠹、*Priobiumcarpini*、褐粉蠹、非洲粉蠹、南方粉蠹、抱扁蠹、软毛粉蠹、扁腿粉蠹、鳞毛粉蠹、材小蠹属、木小蠹属、黑长蠹、红腹榭长蠹、棕异翅长蠹、双棘长蠹属以及竹蠹,并且还有膜翅目,如蓝黑树蜂、大树蜂、泰加大树蜂和*Urocerus augu*,以及白蚁类,如黄颈木白蚁、麻头堆砂白蚁、印巴结构木异白蚁、黄肢散白蚁、桑特散白蚁、欧洲散白蚁、达氏澳白蚁、内华达动白蚁和台湾家白蚁,以及无翼昆虫类,如衣鱼。

[0383] 根据本发明的化合物可以按未经修饰的形式用作杀有害生物剂,但它们通常以多种方式使用配制佐剂(如载体、溶剂以及表面活性物质)被配制成组合物。这些配制品可以处于不同的实体形式,例如,处于以下形式:撒粉剂、凝胶、可湿性粉剂、水可分散性颗粒剂、水可分散性片剂、泡腾压缩片剂、可乳化的浓缩物、微可乳化浓缩物、水包油乳剂、可流动油、水性分散体、油性分散体、悬乳剂、胶囊悬浮液、可乳化的颗粒剂、可溶性液体、水可溶性浓缩物(以水或水混溶性有机溶剂作为载体)、浸渍的聚合物膜或处于已知的其他形式,例如从Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for

Pesticides[关于杀有害生物剂的FAO和WHO标准的发展和使用的手册],联合国,第1版,二次修订(2010)中已知的。此类配制品可以直接使用或者可以使用前稀释再使用。可以用例如水、液体肥料、微量营养素、生物有机体、油或溶剂来进行稀释。

[0384] 可以通过例如将活性成分与配制品佐剂混合来制备这些配制品以便获得处于精细分散固体、颗粒、溶液、分散体或乳剂形式的组合物。这些活性成分还可以与其他佐剂(例如精细分散固体、矿物油、植物或动物来源的油、改性的植物或动物来源的油、有机溶剂、水、表面活性物质或其组合)来一起配制。

[0385] 这些活性成分还可以被包含于非常精细的微胶囊中。微胶囊在多孔载体中含有活性成分。这使活性成分能以受控的量释放(例如,缓慢释放)到环境中。微胶囊通常具有从0.1至500微米的直径。它们含有的活性成分的量按重量计是胶囊重量的约从25%至95%。这些活性成分可以处于整体性的固体的形式、处于固体或液体分散体中的精细颗粒的形式或处于适合溶液的形式。包囊的膜可以包括例如天然的或合成的橡胶、纤维素、苯乙烯/丁二烯共聚物、聚丙烯腈、聚丙烯酸酯、聚酯、聚酰胺、聚脲、聚氨酯或化学改性的聚合物以及淀粉黄原酸酯、或本领域的技术人员已知的其他聚合物。可替代地,可以形成非常精细的微胶囊,其中活性成分在基础物质的固体基质中是以精细分散颗粒的形式被包含的,但这些微胶囊本身未经包裹。

[0386] 适合于制备根据本发明的这些组合物的配制品佐剂本身是已知的。作为液体载体可以使用:水、甲苯、二甲苯、石油醚、植物油、丙酮、甲基乙基酮、环己酮、酸酐、乙腈、乙酰苯、乙酸戊酯、2-丁酮、碳酸丁烯酯、氯苯、环己烷、环己醇、乙酸烷基酯、二丙酮醇、1,2-二氯丙烷、二乙醇胺、对-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-二甲基甲酰胺、二甲基亚砷、1,4-二噁烷、二丙二醇、二丙二醇甲基醚、双丙二醇二苯甲酸酯、二丙二醇、烷基吡咯烷酮、乙酸乙酯、2-乙基己醇、碳酸乙烯酯、1,1,1-三氯乙烷、2-庚酮、 $\alpha$ -蒎烯、d-蒎烯、乳酸乙酯、乙二醇、乙二醇丁基醚、乙二醇甲基醚、 $\gamma$ -丁内酯、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、乙酸异戊基酯、乙酸异冰片基酯、异辛烷、异佛尔酮、异丙苯、肉豆蔻酸异丙酯、乳酸、月桂胺、异亚丙基丙酮、甲氧基丙醇、甲基异戊基酮、甲基异丁基酮、月桂酸甲酯、辛酸甲酯、油酸甲酯、二氯甲烷、间二甲苯、正己烷、正辛胺、十八烷酸、辛胺乙酸酯、油酸、油烯基胺、邻二甲苯、苯酚、聚乙二醇、丙酸、乳酸丙酯、碳酸亚丙酯、丙二醇、丙二醇甲基醚、对-二甲苯、甲苯、磷酸三乙酯、三乙二醇、二甲苯磺酸、石蜡、矿物油、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、异丙醇以及更高分子量的醇,例如戊醇、四氢呋喃醇、己醇、辛醇、乙二醇、丙二醇、甘油、N-甲基-2-吡咯烷酮等。

[0387] 适合的固体载体是例如滑石、二氧化钛、叶蜡石黏土、硅石、凹凸棒石黏土、硅藻土、石灰石、碳酸钙、膨润土、钙蒙脱土、棉籽壳、小麦粉、大豆粉、浮石、木粉、经研磨的胡桃壳、木质素和类似的物质。

[0388] 许多表面活性物质可以有利地用在固体和液体配制品两者中,尤其是在使用前可被载体稀释的那些配制品中。表面活性物质可以是阴离子的、阳离子的、非离子的或聚合的并且它们可以用作乳化剂、湿润剂或悬浮剂或用于其他目的。典型的表面活性物质包括例如烷基硫酸酯的盐,如十二烷基硫酸二乙醇铵;烷基芳基磺酸酯的盐,如十二烷基苯磺酸钙;烷基酚/氧化烯加成产物,如乙氧基化壬基苯酚;醇/氧化烯加成产物,如乙氧基化十三

烷醇;皂,如硬脂酸钠;烷基萘磺酸盐的盐,如二丁基萘磺酸钠;磺基琥珀酸二烷基酯的盐,如二(2-乙基己基)磺基琥珀酸钠;山梨糖醇酯,如山梨糖醇油酸酯;季铵,如氯化十二烷基三甲基铵;脂肪酸的聚乙二醇酯,如聚乙二醇硬脂酸酯;环氧乙烷和环氧丙烷的嵌段共聚物;以及磷酸单和二-烷基酯的盐;以及还有其他物质,例如描述于:McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual[麦卡琴清洁剂和乳化剂年鉴],MC出版公司(MC Publishing Corp.),里奇伍德,新泽西州(Ridgewood New Jersey)(1981)。

[0389] 可以用于杀有害生物配制品的其他佐剂包括结晶抑制剂、粘度改性剂、悬浮剂、染料、抗氧化剂、发泡剂、光吸收剂、混合助剂、消泡剂、络合剂、中和或改变pH的物质和缓冲液、腐蚀抑制剂、香料、湿润剂、吸收增强剂、微量营养素、增塑剂、助流剂、润滑剂、分散剂、增稠剂、防冻剂、杀微生物剂、以及液体和固体肥料。

[0390] 根据本发明的组合物可以包括添加剂,该添加剂包括植物或动物来源的油、矿物油、此类油的烷基酯或此类油与油衍生物的混合物。在根据本发明的组合物中的油添加剂的量通常是基于该待施用的混合物从0.01%至10%。例如,可以在喷雾混合物已经制备之后将该油添加剂以所希望的浓度添加到喷雾罐中。优选的油添加剂包括矿物油或植物来源的油,例如菜籽油、橄榄油或葵花籽油;乳化的植物油;植物来源的油的烷基酯,例如甲基衍生物;或动物来源的油,如鱼油或牛脂。优选的油添加剂包括C<sub>8</sub>-C<sub>22</sub>脂肪酸的烷基酯,尤其是C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>脂肪酸的甲基衍生物,例如月桂酸、棕榈酸以及油酸的甲基酯(分别为月桂酸甲酯、棕榈酸甲酯和油酸甲酯)。许多油衍生物获知于Compendium of Herbicide Adjuvants[除草剂佐剂纲要],第10版,南伊利诺伊大学,2010。

[0391] 这些本发明组合物总体上包含按重量计从0.1%至99%,尤其是按重量计从0.1%至95%的本发明的化合物以及按重量计从1%至99.9%的配制佐剂,该配制佐剂优选地包括按重量计从0%至25%的表面活性物质。而商业产品可以优选地被配制为浓缩物,最终使用者将通常使用稀释配制品。

[0392] 施用比率在宽范围之内变化并且取决于土壤的性质、施用方法、作物植物、待控制的有害生物、主要气候条件、以及受施用方法、施用时间以及目标作物支配的其他因素。一般来讲,可以将化合物以从11/ha至20001/ha、尤其是从101/ha到10001/ha的施用率施用。

[0393] 优选的配制品可以具有以下组成(重量%):

[0394] 可乳化浓缩物:

[0395] 活性成分:1%至95%,优选60%至90%

[0396] 表面活性剂:1%至30%,优选5%至20%

[0397] 液体载体:1%至80%,优选1%至35%

[0398] 尘剂:

[0399] 活性成分:0.1%至10%,优选0.1%至5%

[0400] 固体载体:99.9%至90%,优选99.9%至99%

[0401] 悬浮液浓缩物:

[0402] 活性成分:5%至75%,优选10%至50%

[0403] 水:94%至24%,优选88%至30%

[0404] 表面活性剂:1%至40%,优选2%至30%

[0405] 可湿性粉剂:

- [0406] 活性成分:0.5%至90%,优选1%至80%
- [0407] 表面活性剂:0.5%至20%,优选1%至15%
- [0408] 固体载体:5%至95%,优选15%至90%
- [0409] 颗粒剂:
- [0410] 活性成分:0.1%至30%,优选0.1%至15%
- [0411] 固体载体:99.5%至70%,优选97%至85%
- [0412] 以下实例进一步展示了(但不限制)本发明。

可湿性粉剂	a)	b)	c)
活性成分	25%	50%	75%
木质素磺酸钠	5%	5%	-
月桂基硫酸钠	3%	-	5%
二异丁基萘磺酸钠	-	6%	10%
苯酚聚乙二醇醚(7-8mol的环氧乙烷)	-	2%	-
高度分散的硅胶	5%	10%	10%
高岭土	62%	27%	-

[0414] 将该组合与这些佐剂充分混合并且将混合物在适当的研磨机中充分研磨,从而获得了可以用水稀释而给出所希望的浓度的悬浮液的可湿性粉剂。

干种子处理用的粉剂	a)	b)	c)
活性成分	25%	50%	75%
轻质矿物油	5%	5%	5%
高度分散的硅胶	5%	5%	-
高岭土	65%	40%	-
滑石	-	-	20%

[0416] 将该组合与佐剂充分混合并且将该混合物在适合的研磨机中充分研磨,从而获得可以直接用于种子处理的粉剂。

可乳化浓缩物	
活性成分	10%
辛基酚聚乙二醇醚(4-5mol的环氧乙烷)	3%
十二烷基苯磺酸钙	3%
蓖麻油聚乙二醇醚(35mol的环氧乙烷)	4%
环己酮	30%
二甲苯混合物	50%

[0418] 在植物保护中可以使用的具有任何所要求的稀释的乳液可以通过用水稀释从这种浓缩物中获得。

尘剂	a)	b)	c)
活性成分	5%	6%	4%
滑石	95%	-	-
高岭土	-	94%	-



矿物填料	-	-	96%
------	---	---	-----

[0420] 通过将该组合与载体混合并且将混合物在适当的研磨机中研磨获得立即可用的尘剂。此类粉剂还可以用于种子的干拌种。

[0421]	挤出机颗粒	
	活性成分	15%
	木质素磺酸钠	2%
	羧甲基纤维素	1%
	高岭土	82%

[0422] 将该组合与这些佐剂混合并且研磨，并且将混合物用水湿润。将混合物挤出并且然后在空气流中干燥。

[0423]	包衣颗粒剂	
	活性成分	8%
	聚乙二醇(分子量200)	3%
	高岭土	89%

[0424] 将这种精细研磨的组合在混合器中均匀地施用于用聚乙二醇湿润的高岭土中。以该方式获得非尘的包衣颗粒剂。

[0425] 悬浮液浓缩物

[0426]	活性成分	40%
	丙二醇	10%
	壬基酚聚乙二醇醚 (15 mol 的环氧乙烷)	6%
	木质素磺酸钠	10%
	羧甲基纤维素	1%
	硅酮油 (处于在水中 75% 的乳液的形式)	1%
[0427]	水	32%

[0428] 将精细研磨的组合与佐剂密切混合，从而给出悬浮液浓缩物，可以通过使用水稀释从该浓缩物获得任何所希望稀释度的悬浮液。使用此类稀释物，可以对活的植物连同植物繁殖材料进行处理并且对其针对微生物侵染通过喷雾、浇灌或浸渍进行保护。

[0429] 种子处理用的可流动性浓缩物

[0430]	活性成分	40%
	丙二醇	5%
	共聚物丁醇PO/EO	2%
	三苯乙烯酚, 具有10-20摩尔EO	2%
	1,2-苯并异噻唑啉-3-酮(处于在水中20%的溶液形式)	0.5%
	单偶氮-颜料钙盐	5%

硅酮油(处于在水中75%的乳液的形式)	0.2%
水	45.3%

[0431] 将精细研磨的组合与佐剂密切混合,从而给出悬浮液浓缩物,可以通过使用水稀释从该浓缩物获得任何所希望稀释度的悬浮液。使用此类稀释物,可以对活的植物连同植物繁殖材料进行处理并且对其针对微生物侵染通过喷雾、浇灌或浸渍进行保护。

[0432] 缓释的胶囊悬浮液

[0433] 将28份的组合与2份的芳香族溶剂以及7份的甲苯二异氰酸酯/多亚甲基-聚苯基异氰酸酯-混合物(8:1)进行混合。将该混合物在1.2份的聚乙烯醇、0.05份的消泡剂以及51.6份的水的混合物中进行乳化直至达到所希望的粒度。向该乳液中添加在5.3份的水中的2.8份的1,6-己二胺混合物。将混合物搅拌直至聚合反应完成。将获得的胶囊悬浮液通过添加0.25份的增稠剂以及3份的分散剂进行稳定。该胶囊悬浮液配制品含有28%的活性成分。中等胶囊的直径是8-15微米。将所得配制品作为适用于此目的装置中的水性悬浮液施用到种子上。

[0434] 配制品类型包括乳液浓缩物(EC)、悬浮液浓缩物(SC)、悬乳液(SE)、胶囊悬浮液(CS)、水可分散性颗粒剂(WG)、可乳化的颗粒剂(EG)、油包水型乳液(EO)、水包油型乳液(EW)、微乳液(ME)、油分散体(OD)、油悬剂(OF)、油溶性液剂(OL)、可溶性浓缩物(SL)、超低容量悬浮液(SU)、超低容量液剂(UL)、母药(TK)、可分散性浓缩物(DC)、可湿性粉剂(WP)、可溶性颗粒剂(SG)或与农业上可接受的佐剂组合的任何技术上可行的配制品。

[0435] 制备实例:

[0436] “Mp”意指以°C计的熔点。自由基表示甲基基团。在Brucker 400MHz光谱仪上记录<sup>1</sup>H NMR测量值,化学位移相对于TMS标准物以ppm给出。光谱在如指定的氘代溶剂中测量。用以下LCMS方法中的任一种来表征这些化合物。每种化合物获得的特征性LCMS值是保留时间(“Rt”,以分钟记录)和测得的分子离子(M+H)<sup>+</sup>。

[0437] LCMS和GCMS方法:

[0438] 方法1:

[0439] 质谱图记录在来自沃特斯公司(Waters)的质谱仪(ZQ单四极杆质谱仪)上,其装备有一种电喷射源(极性:正离子或负离子,毛细管电压:3.00kV,锥孔范围:30-60V,萃取器:2.00V,源温度:150°C,去溶剂化温度:350°C,锥孔气体流量:0L/Hr,去溶剂化气体流量:650L/Hr,质量范围:100Da至900Da)和来自沃特斯公司的Acquity UPLC:二元泵,加热柱室以及二极管阵列检测器。溶剂脱气装置,二元泵,加热柱室以及二极管阵列检测器。柱:Waters(沃特斯)UPLC HSS T3,1.8μm,30x 2.1mm,温度:60°C,DAD波长范围(nm):210至500,溶剂梯度:A=水+5%MeOH+0.05%HCOOH,B=乙腈+0.05%HCOOH:梯度:0min 0%B,100%A;1.2-1.5min 100%B;流量(ml/min)0.85。

[0440] 方法2:

[0441] 光谱记录在来自沃特斯公司的质谱仪(SQD或ZQ单四极杆质谱仪)上,其装备有电喷射源(极性:正离子或负离子,毛细管电压:3.00kV,锥孔范围:30-60V,萃取器:2.00V,源温度:150°C,去溶剂化温度:350°C,锥孔气体流量:0L/Hr,去溶剂化气体流量:650L/Hr,质量范围:100Da至900Da)和来自沃特斯公司的AcquityUPLC:二元泵,加热柱室以及二极管阵列检测器。溶剂脱气装置,二元泵,加热柱室以及二极管阵列检测器。柱:Waters(沃特斯)

UPLCHSS T3, 1.8 $\mu$ m, 30x 2.1mm, 温度:60 $^{\circ}$ C, DAD波长范围 (nm): 210至500, 溶剂梯度:A=水+5%MeOH+0.05%HCOOH, B=乙腈+0.05%HCOOH; 梯度:0min 0%B, 100%A; 2.7-3.0min 100%B; 流量(ml/min) 0.85。

[0442] 方法3:

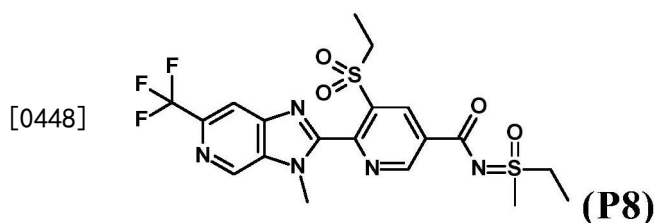
[0443] 在来自安捷伦科技 (Agilent Technologies) 的质谱仪 (6410三重四极杆质谱仪) 上记录光谱, 所述质谱仪配备有电喷雾源 (极性: 正和负极性转换, 毛细管: 4.00kV, 电压: 100.00V, 气体温度: 350 $^{\circ}$ C, 气体流速: 11L/min, 喷雾器气体: 45psi, 质量范围: 110-1000Da; DAD波长范围: 210-400nm)。柱: KINETEX EVO C18, 长度50mm, 直径4.6mm, 粒度2.6 $\mu$ m。柱烘箱温度40 $^{\circ}$ C。溶剂梯度:A=含0.1%甲酸的水:乙腈 (95:5v/v)。B=含0.1%甲酸的乙腈。梯度=0min 90%A, 10%B; 0.9-1.8min 0%A, 100%B, 2.2-2.5min 90%A, 10%B。流速1.8mL/min。

[0444] 方法4:

[0445] 在质谱仪 (Acquity SDS质谱仪) 上记录光谱, 所述质谱仪配备有电喷雾源 (极性: 正和负极性转换, 毛细管: 3.00kV, 锥孔电压: 41.00V, 源温度: 150 $^{\circ}$ C, 去溶剂化气体流量: 1000L/Hr, 去溶剂化温度: 500 $^{\circ}$ C, 气体流速@锥孔: 50L/hr, 质量范围: 110-800Da; PDA波长范围: 210-400nm。柱: Acquity UPLC HSS T3 C18, 长度30mm, 直径2.1mm, 粒度1.8 $\mu$ m。柱烘箱温度40 $^{\circ}$ C。溶剂梯度:A=含0.1%甲酸的水:乙腈 (95:5v/v)。B=含0.05%甲酸的乙腈。梯度=0min 90%A, 10%B; 0.2min 50%A, 50%B; 0.7min-1.3min 0%A, 100%B; 1.4-1.6min 90%A, 10%B。流速0.8mL/min。

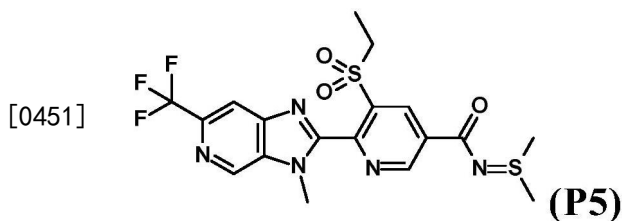
[0446] a) 具有式(I)的化合物的实例的合成:

[0447] 实例P-P1: N-(乙基-甲基-氧代- $\lambda^6$ -硫烷亚基)-5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺 (化合物P8) 的制备:



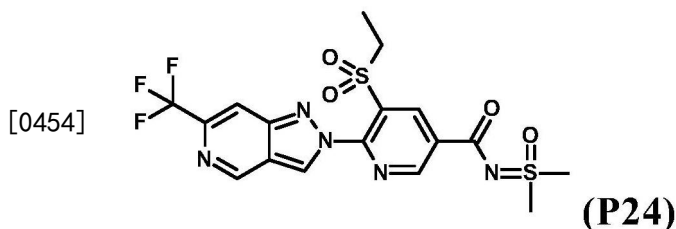
[0449] 在0-5 $^{\circ}$ C下将三乙胺 (0.145ml, 1.040mmol) 和4-(二甲基氨基)吡啶 (1mg) 添加到乙基-亚氨基-甲基-氧代- $\lambda^6$ -硫烷 (78.2mg, 0.693mmol) 在四氢呋喃 (5ml) 中的溶液中, 然后逐滴添加5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-羰基氯 (中间体I3) (300mg, 0.693mmol) 在四氢呋喃 (5ml) 中的溶液。将反应混合物在0-5 $^{\circ}$ C下搅拌30分钟。减压除去溶剂, 并将残余物通过硅胶Combiflash (在环己烷中的0-80%乙酸乙酯) 纯化, 得到呈固体的N-(乙基-甲基-氧代- $\lambda^6$ -硫烷亚基)-5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺 (化合物P8), 熔点113 $^{\circ}$ C-114 $^{\circ}$ C。LCMS (方法1): 504(M+H) $^{+}$ , 保留时间: 0.87min。

[0450] 实例P-P2: N-(二甲基- $\lambda^4$ -硫烷亚基)-5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺 (化合物P5) 的制备:



[0452] 在氩气下向5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺(中间体I4)(430mg,1.04mmol)和五氧化二磷(295mg,2.08mmol)在干氯仿(10ml)中的悬浮液中滴加二甲基亚砷(284mg,0.26ml,3.64mmol)和三乙胺(111mg,152μl,1.09mmol)的混合物,同时保持内部温度低于35℃-40℃。将混合物在室温下搅拌过夜。添加更多的二甲基亚砷(3.64mmol)和三甲胺(1.09mmol)的混合物,并在室温下继续搅拌60小时。将反应混合物小心地倒入冰冷的NaOH水溶液中,同时保持内部温度低于10℃。将水相用氯仿萃取几次,将合并的有机层用水和盐水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并减压浓缩。将残余物通过硅胶Combiflash(在乙酸乙酯中的0-10%甲醇)纯化,得到呈固体的N-(二甲基-λ⁴-硫烷亚基)-5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺(化合物P5)。LCMS(方法1):474(M+H)<sup>+</sup>,保留时间:0.79min。

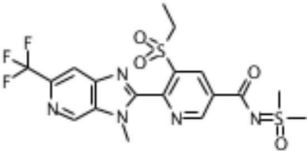
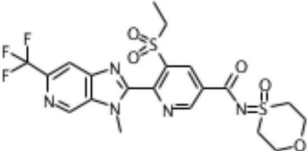
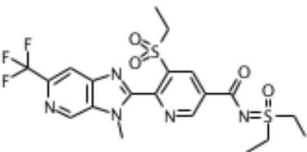
[0453] 实例P-P3:N-[二甲基(氧代)-λ<sup>6</sup>-硫烷亚基]-5-乙基磺酰基-6-[6-(三氟甲基)吡唑并[4,3-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺(化合物P24)的制备



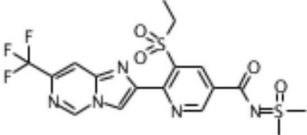
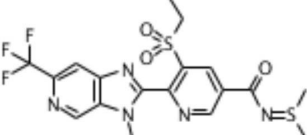
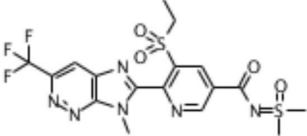
[0455] 将5-乙基磺酰基-6-[6-(三氟-甲基)吡唑并[4,3-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酸(中间体I15)(110mg,0.27mmol)、1-乙基-3-(3-二甲基氨基丙基)碳二亚胺盐酸盐(EDCI,59mg,0.30mmol)和亚氨基-二甲基-氧代-λ<sup>6</sup>-硫烷(30mg,0.30mmol)在吡啶(2ml)中的溶液在80℃下搅拌3个小时。将反应混合物倒入水中并用乙酸乙酯萃取,合并的萃取物用盐水洗涤,经硫酸钠干燥并在减压下浓缩。将残余物通过硅胶Combiflash(乙酸乙酯/己烷9:1)纯化,得到呈固体的N-[二甲基(氧代)-λ<sup>6</sup>-硫烷亚基]-5-乙基磺酰基-6-[6-(三氟甲基)吡唑并[4,3-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺(化合物P24),熔点268℃-270℃。LCMS(方法3):476(M+H)<sup>+</sup>,保留时间:1.41min。<sup>1</sup>H NMR(400MHz,DMSO-d<sub>6</sub>) δppm 1.29(t,J=7.30Hz,3H),3.58(s,6H),4.00(q,J=7.30Hz,2H),8.40(s,1H),8.97(d,J=1.96Hz,1H),9.39(d,J=1.96Hz,1H),9.52(m,2H)。

[0456] 表P:具有式(I)的化合物的实例

编	IUPAC 名称	结构	LCMS	Mp
[0457]				

号			R <sub>t</sub> (min)	[M+H] <sup>+</sup> (测量的)	方法	(°C)
P1	N-[二甲基(氧代)-λ <sup>6</sup> -硫烷-亚基]-5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺		0.83	490	1	202 - 204
P2	5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-N-(4-氧代-1,4-氧硫杂环己烷-4-亚基)吡啶-3-甲酰胺		0.86	532	1	214 - 216
P3	N-[二乙基(氧代)-λ <sup>6</sup> -硫烷-亚基]-5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺		0.90	518	1	111 - 113

[0458]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R <sub>t</sub> (min)	[M+H] <sup>+</sup> (测量的)	方法	
P4	N-[二甲基(氧代)-λ <sup>6</sup> -硫烷-亚基]-5-乙基磺酰基-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺		0.81	476	1	237 - 238
P5	N-(二甲基-λ <sup>4</sup> -硫烷亚基)-5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺		0.79	474	1	
P6	N-[二甲基(氧代)-λ <sup>6</sup> -硫烷-亚基]-5-乙基磺酰基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡嗪-6-基]吡啶-3-甲酰胺		0.83	491	1	197 : -198

[0459]

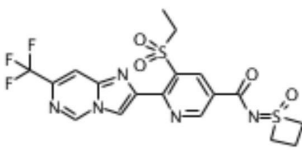
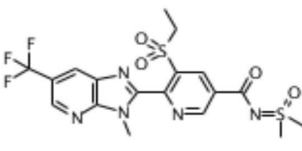
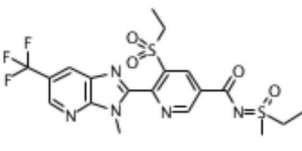
编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R <sub>t</sub> (min)	[M+H] <sup>+</sup> (测量的)	方法	
P7	N-[二甲基(氧代)-λ <sup>6</sup> -硫烷-亚基]-3-乙基磺酰基-4-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]苯甲酰胺		0.83	475	1	187 - 189
P8	N-(乙基-甲基-氧代-λ <sup>6</sup> -硫烷-亚基)-5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺		0.87	504	1	113 - 114
P9	N-(乙基-甲基-氧代-λ <sup>6</sup> -硫烷-亚基)-5-乙基磺酰基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡嗪-6-基]吡啶-3-甲酰胺		0.85	505	1	215 - 217

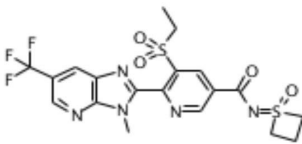
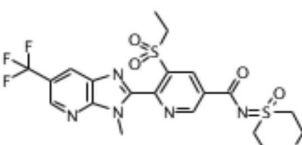
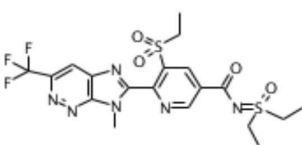
[0460]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R <sub>t</sub> (min)	[M+H] <sup>+</sup> (测量的)	方法	
P10	N-(二乙基-λ <sup>4</sup> -硫烷亚基)-5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺		0.86	502	1	
P11	N-(二甲基-λ <sup>4</sup> -硫烷亚基)-5-乙基磺酰基-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺		0.76	460	1	
P12	5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-N-(1-氧杂硫杂环丁烷-1-亚基)吡啶-3-甲酰胺		0.87	502	1	210 - 212

[0461]



编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R <sub>t</sub> (min)	[M+H] <sup>+</sup> (测量的)	方法	
P13	5-乙基磺酰基-N-(1-氧杂硫杂环丁烷-1-亚基)-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺		0.85	488	1	200 - 202
[0462] P14	N-[二甲基(氧代)-λ <sup>6</sup> -硫烷-亚基]-5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺		0.90	490	1	
P15	N-(乙基-甲基-氧代-λ <sup>6</sup> -硫烷-亚基)-5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺		0.94	504	1	

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R <sub>t</sub> (min)	[M+H] <sup>+</sup> (测量的)	方法	
P16	5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-N-(1-氧杂硫杂环丁烷-1-亚基)吡啶-3-甲酰胺		0.94	502	1	
[0463] P17	5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-N-(4-氧代-1,4-氧硫杂环己烷-4-亚基)吡啶-3-甲酰胺		0.92	532	1	
P18	N-[二乙基(氧代)-λ <sup>6</sup> -硫烷-亚基]-5-乙基磺酰基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡嗪-6-基]吡		0.89	519	1	187 - 189

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R <sub>t</sub> (min)	[M+H] <sup>+</sup> (测量的)	方法	
	吡啶-3-甲酰胺					
P19	N-[二乙基(氧化)-λ <sup>6</sup> -硫烷-亚基]-5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺		0.96	518	1	152 - 155
[0464] P20	N-[二甲基(氧化)-λ <sup>6</sup> -硫烷-亚基]-5-乙基磺酰基-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺					
P21	N-[二乙基(氧化)-λ <sup>6</sup> -硫烷-亚基]-5-乙基磺酰基-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺		0.86	504	1	214 - 218

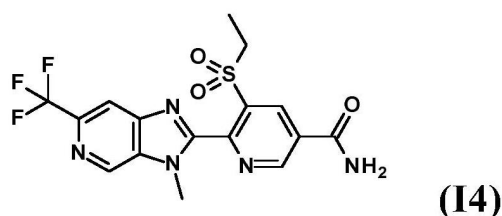
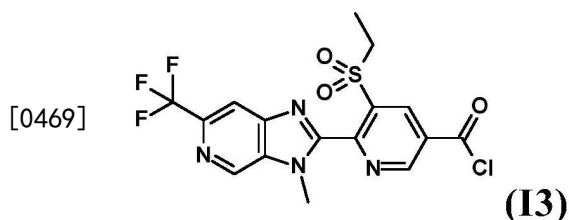
编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R <sub>t</sub> (min)	[M+H] <sup>+</sup> (测量的)	方法	
P22	N-[二甲基(氧化)-λ <sup>6</sup> -硫烷-亚基]-3-乙基磺酰基-4-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯甲酰胺		0.87	489	1	241 - 242
P23	N-[二乙基(氧化)-λ <sup>6</sup> -硫烷-亚基]-3-乙基磺酰基-4-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯甲酰胺		0.93	517	1	192 - 193
P24	N-[二甲基(氧化)-λ <sup>6</sup> -硫烷-亚基]-5-乙基磺酰基-6-[6-(三氟甲基)吡唑并[4,3-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺		1.41	476	3	268 - 270

[0465]

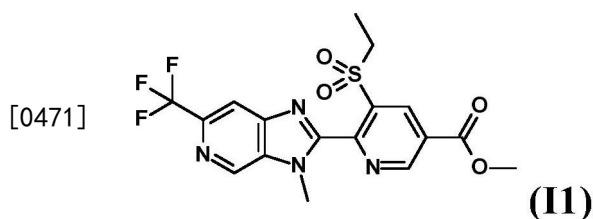
编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R <sub>t</sub> (min)	[M+H] <sup>+</sup> (测量的)	方法	
P25 [0466]	N-(乙基-甲基-氧代-λ <sup>6</sup> -硫烷亚基)-5-乙基磺酰基-6-[6-(三氟甲基)咪唑并[4,3-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺		0.88	490	1	216 - 219
P26	N-[二乙基(氧代)-λ <sup>6</sup> -硫烷-亚基]-5-乙基磺酰基-6-[6-(三氟甲基)咪唑并[4,3-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺		0.91	504	1	185 - 189

[0467] b) 中间体的合成:

[0468] 实例P-I1:5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-羰基氯(中间体I3)和5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺(中间体I4)的制备

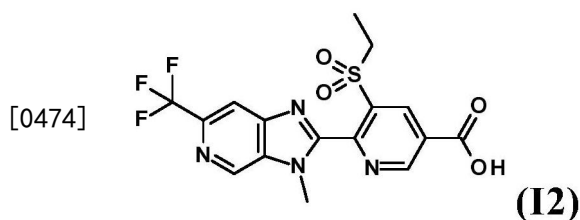


[0470] 步骤P-I1.1:甲基5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酸酯(中间体I1)的合成



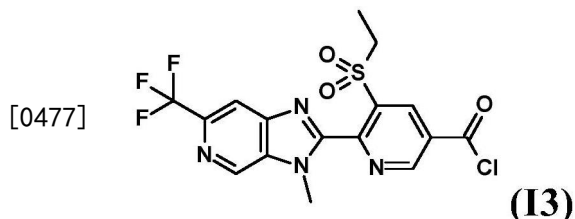
[0472] 在氩气下在高压反应器中装入2-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟-甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶(WO 16/005263) (10.0g, 22.26mmol)在甲醇(111ml)中的脱气溶液。添加三乙胺(2.7g, 3.44ml, 26.71mmol)和二氯[1,3-双(二苯基膦基)丙烷]钯(II) ( $\text{PdCl}_2(\text{dippf})$ ), 0.66g, 1.11mmol)。用5巴一氧化碳对反应容器加压, 并加热至100℃持续24小时。冷却后, 将混合物经硅藻土过滤并将滤液浓缩。将残余物悬浮在乙酸乙酯中, 通过过滤分离固体, 并用水洗涤。将该固体材料溶解在二氯甲烷中, 将溶液经硫酸钠干燥, 过滤并浓缩, 得到呈固体的粗5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酸酯(中间体I1), 熔点200℃-202℃。将此材料不经进一步纯化而使用。LCMS(方法1): 429(M+H)<sup>+</sup>, 保留时间: 0.94min。

[0473] 步骤P-I1.2: 5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酸(中间体I2)的合成



[0475] 在0-5℃下向甲基5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酸酯(5g, 11.67mmol)在四氢呋喃和水(134ml)的3:1混合物中的溶液中添加氢氧化锂一水合物(514mg, 12.25mmol)。将反应混合物在室温搅拌过夜, 然后用叔丁基甲基醚稀释。分离各相, 用盐酸水溶液将水层酸化至pH 2, 并通过过滤分离所得的悬浮液。将该固体残余物溶解在二氯甲烷中, 将溶液经硫酸钠干燥, 过滤并浓缩, 得到呈固体的粗5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酸(中间体I2), 熔点313℃-314℃。将此材料不经进一步纯化而使用。LCMS(方法1): 415(M+H)<sup>+</sup>和413(M-H)<sup>-</sup>, 保留时间0.78min。

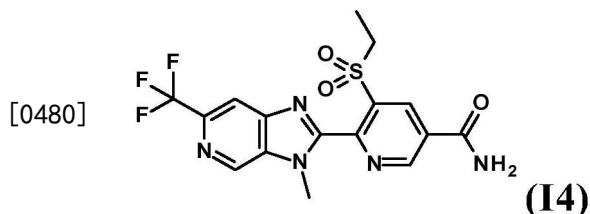
[0476] 步骤P-I1.3: 5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-羰基氯(中间体I3)的合成



[0478] 在0-5℃下向5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酸(3.0g, 7.2mmol)在二氯甲烷(80ml)中的溶液中添加草酰氯(0.76ml, 8.7mmol), 并将混合物在室温下搅拌过夜。将反应混合物浓缩至干, 得到呈固体的粗5-乙基

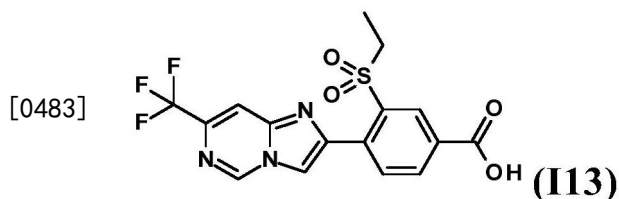
磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-羧基氯(中间体I3)。将此材料不经进一步纯化而使用。<sup>1</sup>H NMR (400MHz, d<sub>6</sub>-丙酮) δppm 1.34 (t, 3H), 3.96 (q, 2H), 4.08 (s, 3H), 8.23 (s, 1H), 9.08 (d, J=2.0Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 9.69 (d, J=2.0Hz, 1H)。

[0479] 步骤P-I1.4:5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺(中间体I4)的合成



[0481] 在0-5℃下,将三乙胺(0.725ml,5.2mmol)和4-(二甲基氨基)吡啶(4mg)添加到氨在二噁烷(69ml,34.5mmol)中的0.5M溶液中,然后逐滴添加5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-羧基氯(中间体I3)(1.5g,3.47mmol)在四氢呋喃(6ml)中的溶液。将反应混合物在0-5℃搅拌30分钟,然后减压浓缩至干,得到呈固体的粗5-乙基-磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺(中间体I4),熔点251℃-252℃。LCMS(方法1):414(M+H)<sup>+</sup>,保留时间:0.76min。

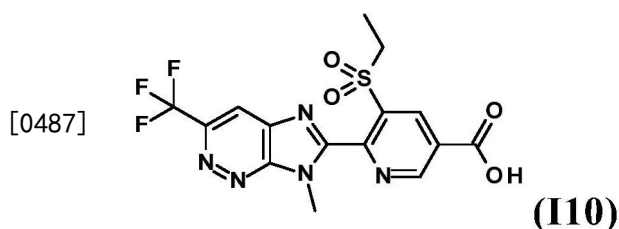
[0482] 实例P-I2:3-乙基磺酰基-4-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]苯甲酸(中间体I13)的制备



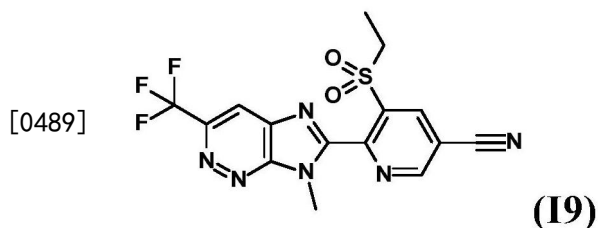
[0484] 向甲基3-乙基磺酰基-4-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]苯甲酸酯(中间体I12)(800mg,1.94mmol)在干N,N-二甲基甲酰胺(15ml)中的溶液中添加干氯化锂LiCl(410mg,9.68mmol),并将该混合物在微波中于150℃加热1小时。重复地添加更多的LiCl(14x82mg),由此在每次添加之后继续在150℃下加热一小时。将反应混合物用水和乙酸乙酯稀释,分离各相,用0.1N盐酸水溶液将水层酸化至pH 4-5,并用乙酸乙酯充分萃取产物。将合并的有机层经硫酸钠干燥,过滤并浓缩,得到呈固体的粗3-乙基磺酰基-4-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]苯甲酸(中间体I13)。将该材料进一步在40℃在真空中经五氧化二磷干燥过夜,并且无需进一步纯化即可使用。

[0485] LCMS(方法1):400(M+H)<sup>+</sup>和398(M-H)<sup>-</sup>,保留时间0.82min。

[0486] 实例P-I3:5-乙基磺酰基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-6-基]吡啶-3-甲酸(中间体I10)的制备

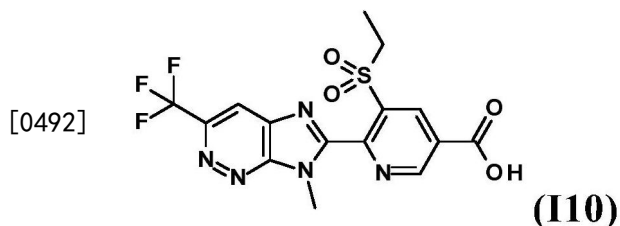


[0488] 步骤P-I3.1:5-乙基磺酰基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡嗪-6-基]吡啶-3-甲腈(中间体I9)的合成



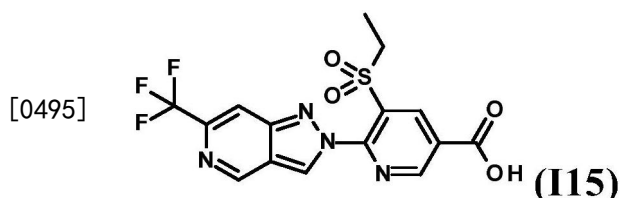
[0490] 向6-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡嗪(WO 16/059145) (900mg, 2.0mmol) 在1-甲基-2-吡咯烷酮(11ml) 中的溶液中添加氰化铜(I) (716mg, 8.0mmol), 并用氩气吹扫反应混合物。添加碘化铜(I) (38mg, 0.20mmol), 并将混合物在微波中于150℃加热一小时。将反应混合物倒入冰水中, 将得到的悬浮液过滤, 并将固体用冷水洗涤。将固体残余物用四氢呋喃处理, 将溶液过滤并将滤液在减压下浓缩至干, 并且该处理用甲苯重复三次。将粗固体在冷的乙酸乙酯中进一步搅拌, 将悬浮液过滤并将固体在50℃下真空干燥过夜, 得到5-乙基磺酰基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡嗪-6-基]吡啶-3-甲腈(中间体I9)。将此材料不经进一步纯化而使用。<sup>1</sup>H NMR (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δppm 1.45(t, J=7.3Hz, 3H), 3.91(q, J=7.3Hz, 2H), 4.15(s, 3H), 8.25(s, 1H), 8.85(d, J=1.8Hz, 1H), 9.29(d, J=1.8Hz, 1H)。LCMS(方法1): 397(M+H)<sup>+</sup>, 保留时间: 0.87min。

[0491] 步骤P-I3.2:5-乙基磺酰基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡嗪-6-基]吡啶-3-甲酸(中间体I10)的合成



[0493] 将5-乙基磺酰基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡嗪-6-基]吡啶-3-甲腈(2.7g, 6.8mmol) 在50%水性硫酸中的溶液(40ml) 在100℃加热2小时。将反应混合物用冰水稀释, 将所得固体过滤, 用冷水洗涤, 并在50℃下在真空中经五氧化二磷干燥过夜, 得到5-乙基磺酰基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡嗪-6-基]吡啶-3-甲酸(中间体I10)。LCMS(方法1): 416(M+H)<sup>+</sup>和414(M-H)<sup>-</sup>, 保留时间0.76min。

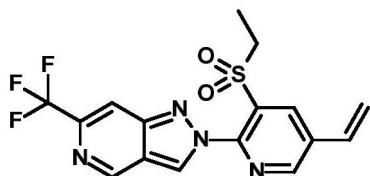
[0494] 实例P-I4:5-乙基磺酰基-6-[6-(三氟-甲基)吡唑并[4,3-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酸(中间体I15)的制备



[0496] 步骤P-I4.1:2-(3-乙基磺酰基-5-乙烯基-2-吡啶基)-6-(三氟甲基)吡唑并[4,3-c]吡啶的合成



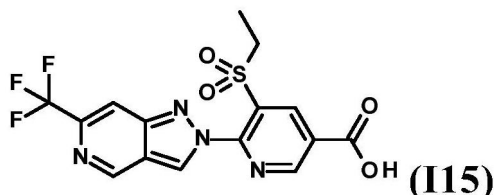
[0497]



[0498] 向2-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-6-(三氟甲基)吡唑并[4,3-c]吡啶(WO 16/020286)(970mg, 2.23mmol)在干甲苯(10ml)中的溶液中添加三丁基(乙烯基)锡(1.09g, 97%, 3.34mmol),并用氩气吹扫反应混合物15分钟。添加四(三苯基膦)钼(0)(129mg, 0.111mmol),并将混合物在110℃加热2小时。将反应混合物倒入水(50ml)中,并用乙酸乙酯(3x30ml)萃取。将合并的萃取物用盐水洗涤,经硫酸钠干燥并在减压下蒸发。将残余物通过硅胶Combiflash(乙酸乙酯/己烷1:1)纯化,得到2-(3-乙基磺酰基-5-乙烯基-2-吡啶基)-6-(三氟甲基)吡唑并[4,3-c]吡啶。LCMS(方法4):383(M+H)<sup>+</sup>,保留时间:1.02min。

[0499] 步骤P-I4.2:5-乙基磺酰基-6-[6-(三氟-甲基)吡唑并[4,3-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酸(中间体I15)的合成

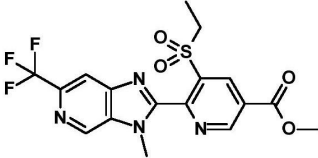
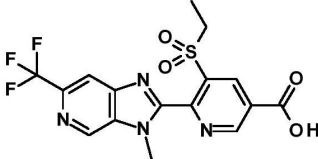
[0500]

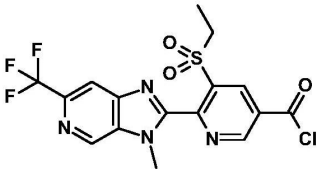
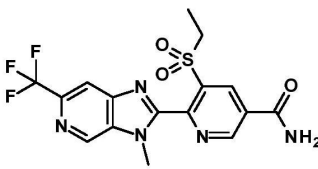
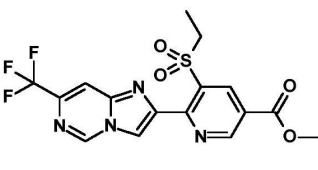
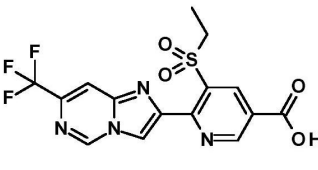


[0501] 在0℃下向2-(3-乙基磺酰基-5-乙烯基-2-吡啶基)-6-(三氟甲基)吡唑并[4,3-c]吡啶(100mg, 0.26mmol)在1,4-二噁烷中的溶液中添加二水合钼酸钾(VI)(48mg, 0.13mmol),然后添加高碘酸钠(117mg, 0.55mmol)的水(2ml)溶液。将反应混合物在室温搅拌3小时。添加另外的高碘酸钠(0.26mmol),并将混合物在室温下进一步搅拌2小时。将反应混合物倒入水(20ml)中,并用2N盐酸水溶液酸化。将产物用乙酸乙酯(3x20ml)萃取,将合并的萃取物用盐水洗涤,经硫酸钠干燥,并减压蒸发,得到呈固体的粗5-乙基磺酰基-6-[6-(三氟-甲基)吡唑并[4,3-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酸(中间体I15)。将此材料不经进一步纯化而使用。<sup>1</sup>H NMR(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δppm 1.31(t, 3H), 4.03(q, 2H), 8.41(s, 1H), 8.93(d, 1H), 9.39(d, 1H), 9.53(m, 2H), 10.32(s, 1H)。LCMS(方法3):401(M+H)<sup>+</sup>和399(M-H)<sup>-</sup>,保留时间1.32min。

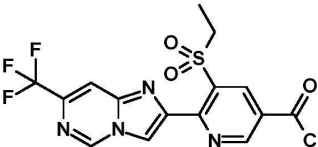
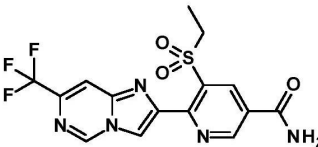
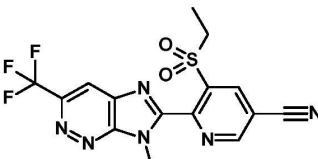
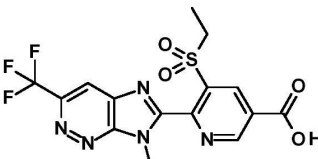
[0502] 表Q:具有式(II)、(IV)、(VIII)、(IX)和(XI)的中间体化合物的实例

[0503]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R <sub>t</sub> (min)	[M+H] <sup>+</sup> (测量的)	方法	
I1	5-乙基磺酰基 -6-[3-甲基 -6-(三氟甲基) 咪唑并[4,5-c] 吡啶-2-基]吡 啶-3-甲酸甲酯		0.94	429	1	200 - 202
I2	5-乙基磺酰基 -6-[3-甲基 -6-(三氟甲基) 咪唑并[4,5-c] 吡啶-2-基]吡 啶-3-甲酸		0.78	415	1	313 - 314

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R <sub>t</sub> (min)	[M+H] <sup>+</sup> (测量的)	方法	
I3	5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-羧基氯		1H NMR 表征: 参见实验部分。			
I4	5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺		0.76	414	1	251 - 252
I5	5-乙基磺酰基-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]吡啶-3-甲酸甲酯		0.92	415	1	230 - 231
I6	5-乙基磺酰基-6-[7-(三氟-甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]吡啶-3-甲酸		0.78	401	1	

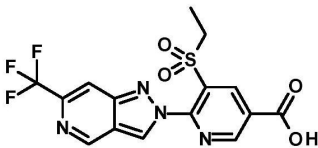
[0504]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R <sub>t</sub> (min)	[M+H] <sup>+</sup> (测量的)	方法	
I7	5-乙基磺酰基-6-[7-(三氟-甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]吡啶-3-羧基氯		<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, d <sub>6</sub> -丙酮) δ ppm: 1.37 (3H), 4.17 (2H), 8.35 (1H), 8.93 (1H), 9.04 (1H), 9.45 (1H), 9.76 (1H)。			
I8	5-乙基磺酰基-6-[7-(三氟-甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]吡啶-3-甲酰胺		0.74	400	1	215 - 216
I9	5-乙基磺酰基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡嗪-6-基]吡啶-3-甲腈		0.87	397	1	
I10	5-乙基磺酰基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡嗪-6-基]吡啶-3-甲酸		0.76	416	1	

[0505]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R <sub>t</sub> (min)	[M+H] <sup>+</sup> (测量的)	方法	
I11	5-乙基磺酰基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡嗪-6-基]吡啶-3-羧基氯		经甲醇等分试样淬灭的 LC-MS 数据 (方法 1): 430(M+H) <sup>+</sup> , 保留时间 0.91 min, 与相应的甲基酯 (C <sub>16</sub> H <sub>14</sub> F <sub>3</sub> N <sub>5</sub> O <sub>4</sub> S, M: 429) 一致。			
I12	甲基 3-乙基磺酰基-4-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]苯甲酸酯		0.95	414	1	263 - 265
I13	3-乙基磺酰基-4-[7-(三氟-甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]苯甲酸		0.82	400	1	
I14	3-乙基磺酰基-4-[7-(三氟-甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]苯甲酰氯		<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, d <sub>6</sub> -丙酮) δ ppm: 1.20 (t, 3H), 3.62 (q, 2H), 8.24 (d, J=8.1 Hz, 1H), 8.25 (s, 1H), 8.57 (dd, J=8.1, 1.8 Hz, 1H), 8.84 (s, 1H), 8.88 (d, J=1.8 Hz, 1H), 9.75 (s, 1H)。			

[0506]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R <sub>t</sub> (min)	[M+H] <sup>+</sup> (测量的)	方法	
[0507] I15	5-乙基磺酰基-6-[6-(三氟-甲基)吡唑并[4,3-c]吡啶-2-基]吡啶-3-甲酸		1.32	401	3	

[0508] 通过添加其他杀昆虫、杀螨和/或杀真菌活性的成分,根据本发明的组合物的活性可以显著地加宽,并且适合于普遍情况。具有式I的化合物与其他杀昆虫、杀螨和/或杀真菌活性的成分的混合物还可以具有另外的出人意料的优点,这些优点还可以在更宽的意义上描述为协同活性。例如,植物对其更好的耐受性、降低的植物毒性、昆虫可以在它们的不同发育阶段得到控制、或者在它们的生产期间(例如,在研磨或者混合期间,在它们的储藏或它们的使用期间)更好的行为。

[0509] 在这里,例如,添加的适当活性成分的代表是以下类别的活性成分:有机磷化合物、硝基苯酚衍生物、硫脲、保幼激素、甲脎、二苯甲酮衍生物、脲类、吡咯衍生物、氨基甲酸酯、拟除虫菊酯、氯化烃、酰基脲、吡啶基亚甲基氨基衍生物、大环内酯类、新烟碱以及苏芸金芽孢杆菌制剂。

[0510] 具有式I的化合物与活性成分的以下混合物是优选的(缩写“TX”表示“选自由本发明的表1至12和表P中所述的化合物组成的组的一种化合物”):

[0511] 佐剂,该佐剂选自由以下组成的物质组:石油(别名)(628)+TX,

[0512] 杀螨剂,该杀螨剂选自由以下组成的物质组:1,1-双(4-氯苯基)-2-乙氧基乙醇(IUPAC名称)(910)+TX、2,4-二氯苯基苯磺酸盐(IUPAC/化学文摘名称)(1059)+TX、2-氟-N-甲基-N-1-萘基乙酰胺(IUPAC名称)(1295)+TX、4-氯苯基苯基砒(IUPAC名称)(981)+TX、阿巴美丁(1)+TX、灭螨醌(3)+TX、乙酰虫腈[CCN]+TX、氟丙菊酯(9)+TX、涕灭威(16)+TX、涕灭砒威(863)+TX、 $\alpha$ -氯氰菊酯(202)+TX、赛果(870)+TX、磺胺螨酯[CCN]+TX、果满磷(872)+TX、胺吸磷(875)+TX、胺吸磷草酸氢盐(875)+TX、双甲脎(24)+TX、杀螨特(881)+TX、三氧化二砷(882)+TX、AVI 382(化合物代码)+TX、AZ 60541(化合物代码)+TX、乙基谷硫磷(44)+TX、甲基谷硫磷(45)+TX、偶氮苯(IUPAC名称)(888)+TX、三唑锡(46)+TX、偶氮磷(889)+TX、苯菌灵(62)+TX、苯噁磷(别名)[CCN]+TX、苯螨特(71)+TX、苯甲酸苄酯(IUPAC名称)[CCN]+TX、联苯肼酯(74)+TX、联苯菊酯(76)+TX、乐杀螨(907)+TX、溴灭菊酯(别名)+TX、溴烯杀(918)+TX、溴硫磷(920)+TX、乙基溴硫磷(921)+TX、溴螨酯(94)+TX、稻虱净(99)+TX、丁酮威(103)+TX、丁酮砒威(104)+TX、丁基吡啶灵(别名)+TX、多硫化钙(IUPAC名称)(111)+TX、毒杀芬(941)+TX、氯灭杀威(943)+TX、西维因(115)+TX、卡巴呋喃(118)+TX、三硫磷(947)+TX、CGA 50' 439(开发代码)(125)+TX、灭螨猛(126)+TX、氯杀螨(959)+TX、杀虫脒(964)+TX、杀虫脒盐酸盐

(964)+TX、溴虫腈(130)+TX、杀螨醇(968)+TX、杀螨酯(970)+TX、敌螨丹(971)+TX、毒虫畏(131)+TX、克氯苯(975)+TX、灭螨咪(977)+TX、灭虫脲(978)+TX、丙酯杀螨醇(983)+TX、毒死蜱(145)+TX、甲基毒死蜱(146)+TX、虫螨磷(994)+TX、瓜菊酯I(696)+TX、瓜菊酯II(696)+TX、瓜菊酯(696)+TX、四螨嗪(158)+TX、氯氰碘柳胺(别名)[CCN]+TX、蝇毒磷(174)+TX、克罗米通(别名)[CCN]+TX、丁烯磷(1010)+TX、硫杂灵(1013)+TX、果虫磷(1020)+TX、丁氟螨酯(CAS登记号:400882-07-7)+TX、三氟氯氰菊酯(196)+TX、三环锡(199)+TX、氯氰菊酯(201)+TX、DCPM(1032)+TX、DDT(219)+TX、田乐磷(1037)+TX、田乐磷-0(1037)+TX、田乐磷-S(1037)+TX、内吸磷(1038)+TX、内吸磷甲基(224)+TX、内吸磷-0(1038)+TX、内吸磷-0-甲基(224)+TX、内吸磷-S(1038)+TX、内吸磷-S-甲基(224)+TX、内吸磷-S-甲基砒(1039)+TX、丁醚脲(226)+TX、氯亚胺硫磷(1042)+TX、二嗪农(227)+TX、抑菌灵(230)+TX、敌敌畏(236)+TX、二克磷(dicliphos)(别名)+TX、开乐散(242)+TX、百治磷(243)+TX、除螨灵(1071)+TX、甲氟磷(1081)+TX、乐果(262)+TX、二活菌素(别名)(653)+TX、消螨酚(1089)+TX、消螨酚(dinex-diclexine)(1089)+TX、消螨通(269)+TX、敌螨普(270)+TX、敌螨普-4[CCN]+TX、敌螨普-6[CCN]+TX、邻敌螨消(1090)+TX、硝戊酯(1092)+TX、硝辛酯(1097)+TX、硝丁酯(1098)+TX、敌杀磷(1102)+TX、二苯砒(IUPAC名称)(1103)+TX、戒酒硫(别名)[CCN]+TX、乙拌磷(278)+TX、DNOC(282)+TX、苯氧炔螨(1113)+TX、多拉菌素(别名)[CCN]+TX、硫丹(294)+TX、因毒磷(1121)+TX、EPN(297)+TX、依立诺克丁(别名)[CCN]+TX、乙硫磷(309)+TX、益果(1134)+TX、乙螨唑(320)+TX、乙嘧硫磷(1142)+TX、抗螨唑(1147)+TX、啞螨醚(328)+TX、苯丁锡(330)+TX、苯硫威(337)+TX、甲氰菊酯(342)+TX、吡螨胺(别名)+TX、啞螨酯(345)+TX、除螨酯(1157)+TX、芳氟胺(1161)+TX、氰戊菊酯(349)+TX、氟虫腈(354)+TX、啞螨酯(360)+TX、啞蜱脲(1166)+TX、氟螨嗪(1167)+TX、氟环脲(366)+TX、氟氰戊菊酯(367)+TX、联氟螨(1169)+TX、氟虫脲(370)+TX、氟氯苯菊酯(372)+TX、氟杀螨(1174)+TX、氟胺氰菊酯(1184)+TX、FMC 1137(开发代码)(1185)+TX、杀螨脒(405)+TX、杀螨脒盐酸盐(405)+TX、安果(1192)+TX、胺甲威(1193)+TX、 $\gamma$ -HCH(430)+TX、果绿定(1205)+TX、苜蓿醚(424)+TX、庚烯磷(432)+TX、十六烷基环丙烷甲酸酯(IUPAC/化学文摘名称)(1216)+TX、噻螨酮(441)+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、水胺硫磷(别名)(473)+TX、异丙基0-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸盐(IUPAC名称)(473)+TX、伊佛霉素(别名)[CCN]+TX、茉莉菊酯I(696)+TX、茉莉菊酯II(696)+TX、碘硫磷(1248)+TX、灵丹(430)+TX、氯芬奴隆(490)+TX、马拉硫磷(492)+TX、丙螨氰(1254)+TX、灭蚜磷(502)+TX、地胺磷(1261)+TX、甲硫芬(别名)[CCN]+TX、虫螨畏(1266)+TX、甲胺磷(527)+TX、杀扑磷(529)+TX、灭虫威(530)+TX、灭多虫(531)+TX、甲基溴(537)+TX、速灭威(550)+TX、速灭磷(556)+TX、兹克威(1290)+TX、密灭汀(557)+TX、米尔贝肟(别名)[CCN]+TX、丙胺氟(1293)+TX、久效磷(561)+TX、茂果(1300)+TX、莫昔克丁(别名)[CCN]+TX、二溴磷(567)+TX、NC-184(化合物代码)+TX、NC-512(化合物代码)+TX、氟蚁灵(1309)+TX、日光霉素(nikkomycins)(别名)[CCN]+TX、戊氰威(1313)+TX、戊氰威1:1氯化锌络合物(1313)+TX、NNI-0101(化合物代码)+TX、NNI-0250(化合物代码)+TX、氧化乐果(594)+TX、草氨酰(602)+TX、异亚砒磷(1324)+TX、砒拌磷(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、对硫磷(615)+TX、苜蓿菊酯(626)+TX、石油(别名)(628)+TX、芬硫磷(1330)+TX、稻丰散(631)+TX、甲拌磷(636)+TX、伏杀磷(637)+TX、硫环磷(1338)+TX、亚胺硫磷(638)+TX、磷胺(639)+TX、辛硫磷(642)+TX、甲基啞啞磷(652)+TX、聚氯萘烯(传统名称)(1347)+TX、浏阳霉素(别名)(653)+

TX、丙氯醇(1350)+TX、丙溴磷(662)+TX、蝉虱威(1354)+TX、克螨特(671)+TX、巴胺磷(673)+TX、残杀威(678)+TX、乙噻唑磷(1360)+TX、发硫磷(1362)+TX、除虫菊酯I(696)+TX、除虫菊酯II(696)+TX、除虫菊酯(696)+TX、哒螨灵(699)+TX、哒嗪硫磷(701)+TX、噻螨醚(706)+TX、噻硫磷(1370)+TX、喹硫磷(quinalphos)(711)+TX、喹硫磷(quintiofos)(1381)+TX、R-1492(开发代码)(1382)+TX、RA-17(开发代码)(1383)+TX、鱼藤酮(722)+TX、八甲磷(1389)+TX、克线丹(别名)+TX、司拉克丁(别名)[CCN]+TX、SI-0009(化合物代码)+TX、苏硫磷(1402)+TX、螺螨酯(738)+TX、螺甲螨酯(739)+TX、SSI-121(开发代码)(1404)+TX、舒非仑(别名)[CCN]+TX、氟虫胺(750)+TX、治螟磷(753)+TX、硫磺(754)+TX、SZI-121(开发代码)(757)+TX、 $\tau$ -氟胺氰菊酯(398)+TX、吡螨胺(763)+TX、TEPP(1417)+TX、叔丁威(别名)+TX、杀虫畏(777)+TX、四氯杀螨砒(786)+TX、杀螨素(别名)(653)+TX、杀螨好(1425)+TX、噻芬诺(别名)+TX、抗虫威(1431)+TX、久效威(800)+TX、甲基乙拌磷(801)+TX、克杀螨(1436)+TX、苏云金素(别名)[CCN]+TX、威菌磷(1441)+TX、苯螨噻(1443)+TX、三唑磷(820)+TX、啞蚜威(triazuron)(别名)+TX、敌百虫(824)+TX、三氯丙氧磷(1455)+TX、三活菌素(别名)(653)+TX、蚜灭多(847)+TX、氟吡啶虫(vaniliprole)[CCN]和YI-5302(化合物代码)+TX、

[0513] 杀藻剂,该杀藻剂选自由以下组成的物质组:3-苯并[b]噻吩-2-基-5,6-二氢-1,4,2-噁噻嗪-4-氧化物[CCN]+TX、二辛酸铜(IUPAC名称)(170)+TX、硫酸铜(172)+TX、cybutryne[CCN]+TX、二氢萘醌(dichlone)(1052)+TX、双氯酚(232)+TX、茵多酸(295)+TX、三苯锡(fentin)(347)+TX、熟石灰[CCN]+TX、代森钠(nabam)(566)+TX、灭藻醌(quinoclamine)(714)+TX、醌苄胺(quinonamid)(1379)+TX、西玛津(730)+TX、三苯锡乙酸盐(IUPAC名称)(347)和氢氧化三苯锡(IUPAC名称)(347)+TX、

[0514] 驱蠕虫剂,该驱蠕虫剂选自由以下组成的物质组:阿巴美丁(1)+TX、克芦磷酯(1011)+TX、多拉克汀(别名)[CCN]+TX、依马克丁(291)+TX、依马克丁苯甲酸酯(291)+TX、依立诺克丁(别名)[CCN]+TX、伊维菌素(别名)[CCN]+TX、米尔贝肟(别名)[CCN]+TX、莫昔克丁(别名)[CCN]+TX、哌嗪[CCN]+TX、塞拉菌素(selamectin)(别名)[CCN]+TX、多杀菌素(737)和硫菌灵(thiophanate)(1435)+TX、

[0515] 杀鸟剂,该杀鸟剂选自由以下组成的物质组:氯醛糖(127)+TX、异狄氏剂(1122)+TX、倍硫磷(346)+TX、吡啶-4-胺(IUPAC名称)(23)和土的宁(745)+TX、

[0516] 杀细菌剂,该杀细菌剂选自由以下组成的物质组:1-羟基-1H-吡啶-2-硫酮(IUPAC名称)(1222)+TX、4-(喹啉啉-2-基氨基)苯磺酰胺(IUPAC名称)(748)+TX、8-羟基喹啉硫酸盐(446)+TX、溴硝醇(97)+TX、二辛酸铜(IUPAC名称)(170)+TX、氢氧化铜(IUPAC名称)(169)+TX、甲酚[CCN]+TX、双氯酚(232)+TX、双吡硫翁(1105)+TX、多地辛(1112)+TX、敌磺钠(fenamiosulf)(1144)+TX、甲醛(404)+TX、汞加芬(别名)[CCN]+TX、春雷霉素(483)+TX、春雷霉素盐酸盐水合物(483)+TX、二(二甲基二硫代氨基甲酸盐)镍(IUPAC名称)(1308)+TX、三氯甲基吡啶(nitrapyrin)(580)+TX、辛噻酮(octhilinone)(590)+TX、奥索利酸(606)+TX、土霉素(611)+TX、羟基喹啉硫酸钾(446)+TX、烯丙苯噻唑(probenazole)(658)+TX、链霉素(744)+TX、链霉素倍半硫酸盐(744)+TX、叶枯酞(766)+TX、和硫柳汞(别名)[CCN]+TX、

[0517] 生物试剂,该生物试剂选自由以下组成的物质组:棉褐带卷蛾颗粒体病毒(Adoxophyes orana GV)(别名)(12)+TX、放射形土壤杆菌(别名)(13)+TX、捕食螨(Amblyseius spp.)(别名)(19)+TX、芹菜夜蛾核多角体病毒(Anagrapha falcifera NPV)



(别名) (28)+TX、原樱翅缨小蜂 (*Anagrus atomus*) (别名) (29)+TX、短距蚜小蜂 (*Aphelinus abdominalis*) (别名) (33)+TX、棉蚜寄生蜂 (*Aphidius colemani*) (别名) (34)+TX、食蚜瘿蚊 (*Aphidoletes aphidimyza*) (别名) (35)+TX、苜蓿银纹夜蛾核多角体病毒 (*Autographa californica* NPV) (别名) (38)+TX、坚硬芽孢杆菌 (*Bacillus firmus*) (别名) (48)+TX、球形芽孢杆菌 (*Bacillus sphaericus* Neide) (学名) (49)+TX、苏云金芽孢杆菌 (*Bacillus thuringiensis* Berliner) (学名) (51)+TX、苏云金芽孢杆菌鲑泽亚种 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*) (学名) (51)+TX、苏云金芽孢杆菌以色列亚种 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*) (学名) (51)+TX、苏云金芽孢杆菌日本亚种 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis*) (学名) (51)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*) (学名) (51)+TX、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*) (学名) (51)+TX、球孢白僵菌 (*Beauveria bassiana*) (别名) (53)+TX、布氏白僵菌 (*Beauveria brongniartii*) (别名) (54)+TX、草蜻蛉 (*Chrysoperla carnea*) (别名) (151)+TX、孟氏隐唇瓢虫 (*Cryptolaemus montrouzieri*) (别名) (178)+TX、苹果蠹蛾颗粒体病毒 (*Cydia pomonella* GV) (别名) (191)+TX、西伯利亚离颚茧蜂 (*Dacnusa sibirica*) (别名) (212)+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂 (*Diglyphus isaea*) (别名) (254)+TX、丽蚜小蜂 (*Encarsia formosa*) (学名) (293)+TX、桨角蚜小蜂 (*Eretmocerus eremicus*) (别名) (300)+TX、玉米穗夜蛾核多角体病毒 (*Helicoverpa zea* NPV) (别名) (431)+TX、嗜菌异小杆线虫 (*Heterorhabditis bacteriophora*) 和 *H. megidis* (别名) (433)+TX、会聚长足瓢虫 (*Hippodamia convergens*) (别名) (442)+TX、橘粉介壳虫寄生蜂 (*Leptomastix dactylopii*) (别名) (488)+TX、盲蝽 (*Macrolophus caliginosus*) (别名) (491)+TX、甘蓝夜蛾核多角体病毒 (*Mamestra brassicae* NPV) (别名) (494)+TX、黄阔柄跳小蜂 (*Metaphycus helvolus*) (别名) (522)+TX、黄绿绿僵菌 (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) (学名) (523)+TX、金龟子绿僵菌小孢变种 (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) (学名) (523)+TX、松黄叶蜂 (*Neodiprion sertifer*) 核多角体病毒和红头松树叶蜂 (*N. lecontei*) 核多角体病毒 (别名) (575)+TX、小花蝽属物种 (别名) (596)+TX、玫烟色拟青霉 (*Paecilomyces fumosoroseus*) (别名) (613)+TX、智利捕植螨 (*Phytoseiulus persimilis*) (别名) (644)+TX、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua* multicapsid) 多核衣壳核多角体病毒 (学名) (741)+TX、毛蚊线虫 (*Steinernema bibionis*) (别名) (742)+TX、小卷蛾斯氏线虫 (*Steinernema carpocapsae*) (别名) (742)+TX、夜蛾斯氏线虫 (别名) (742)+TX、格氏线虫 (*Steinernema glaseri*) (别名) (742)+TX、锐比斯氏线虫 (*Steinernema riobrave*) (别名) (742)+TX、*Steinernema riobrave* (别名) (742)+TX、*Steinernema scapterisci* (别名) (742)+TX、斯氏线虫属 (*Steinernema* spp.) (别名) (742)+TX、赤眼蜂属 (别名) (826)+TX、西方盲走螨 (*Typhlodromus occidentalis*) (别名) (844) 和蜡蚧轮枝菌 (*Verticillium lecanii*) (别名) (848)+TX,

[0518] 土壤消毒剂, 该土壤消毒剂选自由以下组成的物质组: 碘甲烷 (IUPAC名称) (542) 和溴甲烷 (537)+TX,

[0519] 化学不育剂, 该化学不育剂选自由以下组成的物质组: 啞磷嗪 (apholate) [CCN]+TX、双(氮丙啶)甲氨基磷硫化物 (bisazir) (别名) [CCN]+TX、白消安 (别名) [CCN]+TX、除虫脲 (250)+TX、迪麦替夫 (dimatif) (别名) [CCN]+TX、六甲蜜胺 (heme1) [CCN]+TX、六甲磷

(hempa) [CCN]+TX、甲基涕巴 (metepa) [CCN]+TX、甲硫涕巴 (methiotepa) [CCN]+TX、不育特 (methyl apholate) [CCN]+TX、不孕啉 (morzid) [CCN]+TX、氟幼脲 (penfluron) (别名) [CCN]+TX、涕巴 (tepa) [CCN]+TX、硫代六甲磷 (thiohempa) (别名) [CCN]+TX、硫涕巴 (别名) [CCN]+TX、曲他胺 (别名) [CCN] 和尿烷亚胺 (别名) [CCN]+TX,

[0520] 昆虫信息素,该昆虫信息素选自由以下组成的物质组:(E)-癸-5-烯-1-基乙酸酯与(E)-癸-5-烯-1-醇(IUPAC名称)(222)+TX、(E)-十三碳-4-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(829)+TX、(E)-6-甲基庚-2-烯-4-醇(IUPAC名称)(541)+TX、(E,Z)-十四碳-4,10-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(779)+TX、(Z)-十二碳-7-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(285)+TX、(Z)-十六碳-11-烯醛(IUPAC名称)(436)+TX、(Z)-十六碳-11-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(437)+TX、(Z)-十六碳-13-烯-11-炔-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(438)+TX、(Z)-二十-13-烯-10-酮(IUPAC名称)(448)+TX、(Z)-十四碳-7-烯-1-醛(IUPAC名称)(782)+TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-醇(IUPAC名称)(783)+TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(784)+TX、(7E,9Z)-十二碳-7,9-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(283)+TX、(9Z,11E)-十四碳-9,11-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(780)+TX、(9Z,12E)-十四碳-9,12-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(781)+TX、14-甲基十八碳-1-烯(IUPAC名称)(545)+TX、4-甲基壬-5-醇与4-甲基壬-5-酮(IUPAC名称)(544)+TX、 $\alpha$ -多纹素(multistriatin)(别名)[CCN]+TX、西部松小蠹集合信息素(brevicomine)(别名)[CCN]+TX、十二碳二烯醇(codlure)(别名)[CCN]+TX、可得蒙(codlemone)(别名)(167)+TX、诱蝇酮(cuelure)(别名)(179)+TX、环氧十九烷(disparlure)(277)+TX、十二碳-8-烯-1基乙酸酯(IUPAC名称)(286)+TX、十二碳-9-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(287)+TX、十二碳-8+TX、10-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(284)+TX、dominicalure(别名)[CCN]+TX、4-甲基辛酸乙酯(IUPAC名称)(317)+TX、丁香酚(别名)[CCN]+TX、南部松小蠹集合信息素(frontalin)(别名)[CCN]+TX、诱虫十六酯(gossyplure)(别名)(420)+TX、诱杀烯混剂(grandlure)(421)+TX、诱杀烯混剂I(别名)(421)+TX、诱杀烯混剂II(别名)(421)+TX、诱杀烯混剂III(别名)(421)+TX、诱杀烯混剂IV(别名)(421)+TX、醋酸十六烯酯(hexalure)[CCN]+TX、齿小蠹二烯醇(ipsdienol)(别名)[CCN]+TX、小蠹烯醇(ipsenol)(别名)[CCN]+TX、金龟子性诱剂(japonilure)(别名)(481)+TX、lineatin(别名)[CCN]+TX、litlure(别名)[CCN]+TX、粉纹夜蛾性诱剂(looplure)(别名)[CCN]+TX、诱杀酯(medlure)[CCN]+TX、megatomoic acid(别名)[CCN]+TX、诱虫醚(methyl eugenol)(别名)(540)+TX、诱虫烯(muscalure)(563)+TX、十八碳-2,13-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(588)+TX、十八碳-3,13-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(589)+TX、贺康彼(orfralure)(别名)[CCN]+TX、oryctalure(别名)(317)+TX、非乐康(ostramone)(别名)[CCN]+TX、诱虫环(siglure)[CCN]+TX、sordidin(别名)(736)+TX、食菌甲诱醇(sulcatol)(别名)[CCN]+TX、十四碳-11-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(785)+TX、特诱酮(839)+TX、特诱酮A(别名)(839)+TX、特诱酮B<sub>1</sub>(别名)(839)+TX、特诱酮B<sub>2</sub>(别名)(839)+TX、特诱酮C(别名)(839)和truncall(别名)[CCN]+TX,

[0521] 昆虫驱避剂,该昆虫驱避剂选自由以下组成的物质组:2-(辛基硫代)乙醇(IUPAC名称)(591)+TX、避蚊酮(butopyronoxyl)(933)+TX、丁氧基(聚丙二醇)(936)+TX、己二酸二丁酯(IUPAC名称)(1046)+TX、邻苯二甲酸二丁酯(1047)+TX、丁二酸二丁酯(IUPAC名称)(1048)+TX、避蚊胺[CCN]+TX、驱蚊酯(dimethyl carbate)[CCN]+TX、邻苯二甲酸二甲酯

[CCN]+TX、乙基己二醇(1137)+TX、己脲[CCN]+TX、甲喹丁(methoquin-butyl)(1276)+TX、甲基新癸酰胺[CCN]+TX、氧羰基甲酸酯(oxamate)[CCN]和羟吡啶酯[CCN]+TX,

[0522] 杀昆虫剂,该杀昆虫剂选自由以下组成的物质组:1-二氯-1-硝基乙烷(IUPAC/化学文摘名)(1058)+TX、1,1-二氯-2,2-双(4-乙基苯基)乙烷(IUPAC名称)(1056)+TX、1,2-二氯丙烷(IUPAC/化学文摘名)(1062)+TX、1,2-二氯丙烷与1,3-二氯丙烯(IUPAC名称)(1063)+TX、1-溴-2-氯乙烷(IUPAC/化学文摘名)(916)+TX、2,2,2-三氯-1-(3,4-二氯苯基)乙基乙酸酯(IUPAC名称)(1451)+TX、2,2-二氯乙烯基2-乙基亚磺酰基乙基甲基磷酸酯(IUPAC名称)(1066)+TX、2-(1,3-二硫杂环戊烷-2-基)苯基二甲基氨基甲酸酯(IUPAC/化学文摘名)(1109)+TX、2-(2-丁氧基乙氧基)乙基硫氰酸酯(IUPAC/化学文摘名)(935)+TX、2-(4,5-二甲基-1,3-二氧戊环-2-基)苯基甲基氨基甲酸酯(IUPAC/化学文摘名)(1084)+TX、2-(4-氯-3,5-二甲苯基氧基)乙醇(IUPAC名称)(986)+TX、2-氯乙烯基二乙基磷酸酯(IUPAC名称)(984)+TX、2-咪唑烷酮(IUPAC名称)(1225)+TX、2-异戊酰基茛满-1,3-二酮(IUPAC名称)(1246)+TX、2-甲基(丙-2-炔基)氨基苯基甲基氨基甲酸酯(IUPAC名称)(1284)+TX、2-硫代氰酰乙基月桂酸酯(IUPAC名称)(1433)+TX、3-溴-1-氯丙-1-烯(IUPAC名称)(917)+TX、3-甲基-1-苯基吡啶-5-基二甲基氨基甲酸酯(IUPAC名称)(1283)+TX、4-甲基(丙-2-炔基)氨基-3,5-二甲苯基甲基氨基甲酸酯(IUPAC名称)(1285)+TX、5,5-二甲基-3-氧代环己-1-烯基二甲基氨基甲酸酯(IUPAC名称)(1085)+TX、阿巴美丁(1)+TX、乙酰甲胺磷(2)+TX、啉虫脒(4)+TX、家蝇磷(别名)[CCN]+TX、乙酰虫脒[CCN]+TX、氟丙菊酯(9)+TX、丙烯腈(IUPAC名称)(861)+TX、棉铃威(15)+TX、涕灭威(16)+TX、涕灭砒威(863)+TX、阿耳德林(864)+TX、丙烯菊酯(17)+TX、阿洛氨基素(别名)[CCN]+TX、除害威(866)+TX、 $\alpha$ -氯氰菊酯(202)+TX、 $\alpha$ -蜕皮激素(别名)[CCN]+TX、磷化铝(640)+TX、赛果(870)+TX、果满磷(872)+TX、灭害威(873)+TX、胺吸磷(875)+TX、草酸氢胺吸磷(875)+TX、双甲脒(24)+TX、新烟碱(877)+TX、乙基杀扑磷(883)+TX、AVI 382(化合物代码)+TX、AZ 60541(化合物代码)+TX、印楝素(别名)(41)+TX、甲基吡啶磷(42)+TX、益棉磷(44)+TX、甲基谷硫磷(45)+TX、偶氮磷(889)+TX、苏云金芽孢杆菌 $\delta$ -内毒素(别名)(52)+TX、六氟合硅酸钡(别名)[CCN]+TX、多硫化钡(IUPAC/化学文摘名)(892)+TX、熏菊酯[CCN]+TX、拜耳22/190(开发代码)(893)+TX、拜耳22408(开发代码)(894)+TX、恶虫威(58)+TX、丙硫克百威(60)+TX、杀虫磺(66)+TX、 $\beta$ -氟氯氰菊酯(194)+TX、 $\beta$ -氯氰菊酯(203)+TX、联苯菊酯(76)+TX、生物丙烯菊酯(78)+TX、生物丙烯菊酯S-环戊烯基异构体(别名)(79)+TX、生物环吡菊酯(bioethanomethrin)[CCN]+TX、生物氯菊酯(908)+TX、生物苜蓿菊酯(80)+TX、双(2-氯乙基)醚(IUPAC名称)(909)+TX、双三氟虫脒(83)+TX、硼砂(86)+TX、溴灭菊酯(别名)+TX、溴苯烯磷(914)+TX、溴烯杀(918)+TX、溴-DDT(别名)[CCN]+TX、溴硫磷(920)+TX、溴硫磷-乙基(921)+TX、合杀威(924)+TX、噻嗪酮(99)+TX、畜虫威(926)+TX、特噻硫磷(butathiofos)(927)+TX、丁酮威(103)+TX、丁酯磷(932)+TX、丁酮砒威(104)+TX、丁基吡啶灵(别名)+TX、硫线磷(109)+TX、砷酸钙[CCN]+TX、氰化钙(444)+TX、多硫化钙(IUPAC名称)(111)+TX、毒杀芬(941)+TX、氯灭杀威(943)+TX、西维因(115)+TX、克百威(118)+TX、二硫化碳(IUPAC/化学文摘名)(945)+TX、四氯化碳(IUPAC名称)(946)+TX、三硫磷(947)+TX、丁硫克百威(119)+TX、杀螟丹(123)+TX、杀螟丹盐酸盐(123)+TX、藜芦碱(别名)(725)+TX、冰片丹(960)+TX、氯丹(128)+TX、十氯酮(963)+TX、杀虫脒(964)+TX、杀虫脒盐酸盐(964)+TX、氯氧磷(129)+TX、溴虫脒(130)+TX、毒虫畏(131)+TX、氟啶脒(132)+TX、氯

甲磷(136)+TX、氯仿[CCN]+TX、氯化苦(141)+TX、氯腈肟磷(989)+TX、灭虫吡啉(chlorprazophos)(990)+TX、毒死蜱(145)+TX、甲基毒死蜱(146)+TX、虫螨磷(994)+TX、环虫酰肼(150)+TX、瓜菊酯I(696)+TX、瓜菊酯II(696)+TX、瓜菊酯(696)+TX、顺式苜蓿菊酯(别名)+TX、苜蓿菊酯(80)+TX、功夫菊酯(别名)+TX、除线威(999)+TX、氯氰碘柳胺(别名)[CCN]+TX、噻虫胺(165)+TX、乙酰亚砷酸铜[CCN]+TX、砷酸铜[CCN]+TX、油酸铜[CCN]+TX、蝇毒磷(174)+TX、畜虫磷(1006)+TX、克罗米通(别名)[CCN]+TX、丁烯磷(1010)+TX、育畜磷(1011)+TX、冰晶石(别名)(177)+TX、CS 708(开发代码)(1012)+TX、苯腈膦(1019)+TX、杀螟腈(184)+TX、果虫磷(1020)+TX、环虫菊[CCN]+TX、乙氰菊酯(188)+TX、氟氯氰菊酯(193)+TX、氯氟氰菊酯(196)+TX、氯氰菊酯(201)+TX、苯氰菊酯(206)+TX、灭蝇胺(209)+TX、赛灭磷(别名)[CCN]+TX、d-柠檬烯(别名)[CCN]+TX、d-胺菊酯(别名)(788)+TX、DAEP(1031)+TX、棉隆(216)+TX、DDT(219)+TX、二克百威(decarbofuran)(1034)+TX、溴氰菊酯(223)+TX、田乐磷(1037)+TX、田乐磷-0(1037)+TX、田乐磷-S(1037)+TX、内吸磷(1038)+TX、内吸磷-甲基(224)+TX、内吸磷-0(1038)+TX、内吸磷-0-甲基(224)+TX、内吸磷-S(1038)+TX、内吸磷-S-甲基(224)+TX、内吸磷-S-甲基砷(demeton-S-methylsulphon)(1039)+TX、杀螨隆(226)+TX、氯亚磷(1042)+TX、除线特(diamidafos)(1044)+TX、二嗪农(227)+TX、异氯磷(1050)+TX、除线磷(1051)+TX、敌敌畏(236)+TX、dicliphos(别名)+TX、dicresyl(别名)[CCN]+TX、百治磷(243)+TX、地昔尼尔(244)+TX、狄氏剂(1070)+TX、二乙基5-甲基吡啶-3-基磷酸酯(IUPAC名称)(1076)+TX、除虫脲(250)+TX、二羟丙茶碱(dilor)(别名)[CCN]+TX、四氟甲醚菊酯[CCN]+TX、甲氟磷(1081)+TX、地麦威(1085)+TX、乐果(262)+TX、苜蓿菊酯(1083)+TX、甲基毒虫畏(265)+TX、敌蝇威(1086)+TX、消螨酚(1089)+TX、消螨酚-diclexine(1089)+TX、硝丙酚(1093)+TX、戊硝酚(1094)+TX、地乐酚(1095)+TX、呋虫胺(271)+TX、苯虫醚(1099)+TX、蔬果磷(1100)+TX、二氧威(1101)+TX、敌杀磷(1102)+TX、乙拌磷(278)+TX、dithicrofos(1108)+TX、DNOC(282)+TX、多拉克汀(别名)[CCN]+TX、DSP(1115)+TX、蜕皮甾酮(别名)[CCN]+TX、EI 1642(开发代码)(1118)+TX、甲氨基阿维菌素(291)+TX、甲氨基阿维菌素苯甲酸酯(291)+TX、EMPC(1120)+TX、烯炔菊酯(292)+TX、硫丹(294)+TX、因毒磷(1121)+TX、异狄氏剂(1122)+TX、EPBP(1123)+TX、EPN(297)+TX、保幼醚(1124)+TX、依立诺克丁(别名)[CCN]+TX、高氰戊菊酯(302)+TX、etaphos(别名)[CCN]+TX、杀虫丹(308)+TX、乙硫磷(309)+TX、乙虫腈(310)+TX、益硫磷(ethoate-methyl)(1134)+TX、灭线磷(312)+TX、甲酸乙酯(IUPAC名称)[CCN]+TX、乙基-DDD(别名)(1056)+TX、二溴化乙烯(316)+TX、二氯化乙烯(化学名)(1136)+TX、环氧乙烷[CCN]+TX、醚菊酯(319)+TX、乙嘧硫磷(1142)+TX、EXD(1143)+TX、氨磺磷(323)+TX、苯线磷(326)+TX、抗螨唑(1147)+TX、皮蝇磷(1148)+TX、双乙威(1149)+TX、芬氟司林(1150)+TX、杀螟硫磷(335)+TX、仲丁威(336)+TX、fenoxacrim(1153)+TX、苯氧威(340)+TX、吡氯氰菊酯(1155)+TX、甲氰菊酯(342)+TX、fenpyrad(别名)+TX、丰索磷(1158)+TX、倍硫磷(346)+TX、乙基倍硫磷[CCN]+TX、氰戊菊酯(349)+TX、氟虫腈(354)+TX、氟啶虫酰胺(358)+TX、氟虫双酰胺(CAS登记号:272451-65-7)+TX、氟氰戊菊酯(1168)+TX、氟螨脲(366)+TX、氟氰戊菊酯(367)+TX、联氟螨(1169)+TX、噻虫胺[CCN]+TX、氟虫脲(370)+TX、三氟醚菊酯(1171)+TX、氟氯苯菊酯(372)+TX、氟胺氰菊酯(1184)+TX、FMC 1137(开发代码)(1185)+TX、地虫磷(1191)+TX、伐虫脒(405)+TX、伐虫脒盐酸盐(405)+TX、安果(1192)+TX、formparanate(1193)+TX、丁苯硫磷(1194)+TX、福司吡酯(1195)+TX、噻唑磷(408)+TX、丁硫

环磷(1196)+TX、呋线威(412)+TX、抗虫菊(1200)+TX、 $\gamma$ -氯氟氰菊酯(197)+TX、 $\gamma$ -HCH(430)+TX、双胍盐(422)+TX、双胍醋酸盐(422)+TX、GY-81(开发代码)(423)+TX、苜蓿磷(424)+TX、氯虫酰肼(425)+TX、HCH(430)+TX、HEOD(1070)+TX、七氯(1211)+TX、庚烯醚(432)+TX、速杀硫磷[CCN]+TX、氟铃脲(439)+TX、HHDN(864)+TX、伏蚁脲(443)+TX、氢氰酸(444)+TX、烯虫乙酯(445)+TX、喹啉威(hyquincarb)(1223)+TX、吡虫啉(458)+TX、咪炔菊酯(460)+TX、茛虫威(465)+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、IPSP(1229)+TX、氯唑磷(1231)+TX、碳氯灵(1232)+TX、水胺硫磷(别名)(473)+TX、异艾氏剂(1235)+TX、异柳磷(1236)+TX、异索威(isolan)(1237)+TX、异丙威(472)+TX、异丙基O-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸酯(IUPAC名称)(473)+TX、稻瘟灵(474)+TX、异拌磷(1244)+TX、异恶唑磷(isoxathion)(480)+TX、伊维菌素(别名)[CCN]+TX、茛菊素I(696)+TX、茛菊素II(696)+TX、碘硫磷(1248)+TX、保幼激素I(别名)[CCN]+TX、保幼激素II(别名)[CCN]+TX、保幼激素III(别名)[CCN]+TX、克来范(1249)+TX、烯虫炔酯(484)+TX、 $\lambda$ -氯氟氰菊酯(198)+TX、砷酸铅[CCN]+TX、lepimectin(CCN)+TX、溴苯磷(1250)+TX、林丹(430)+TX、啶虫磷(lirimfos)(1251)+TX、虱螨脲(490)+TX、噻唑磷(1253)+TX、间异丙苯基甲基氨基甲酸酯(IUPAC名称)(1014)+TX、磷化镁(IUPAC名称)(640)+TX、马拉硫磷(492)+TX、丙螨氰(1254)+TX、叠氮磷(1255)+TX、灭蚜磷(502)+TX、甲基灭蚜磷(1258)+TX、灭蚜硫磷(1260)+TX、地胺磷(1261)+TX、氯化亚汞(513)+TX、甲亚砷磷(mesulfenfos)(1263)+TX、氰氟虫脲(CCN)+TX、百亩(别名)(519)+TX、百亩-钾盐(别名)(519)+TX、百亩-钠盐(519)+TX、虫螨畏(1266)+TX、甲胺磷(527)+TX、甲基磺酰氟(IUPAC/化学文摘名)(1268)+TX、杀扑磷(529)+TX、甲硫威(530)+TX、丁烯胺磷(methocrotophos)(1273)+TX、灭多威(531)+TX、烯虫酯(532)+TX、甲啶丁(methoquin-butyl)(1276)+TX、甲醚菊酯(别名)(别名)(533)+TX、甲氧滴滴涕(534)+TX、甲氧虫酰肼(535)+TX、溴甲烷(537)+TX、异硫氰酸甲酯(543)+TX、甲基氯仿(别名)[CCN]+TX、二氯甲烷[CCN]+TX、甲氧苄氟菊酯[CCN]+TX、速灭威(550)+TX、恶虫酮(metoxadiazone)(1288)+TX、速灭磷(556)+TX、自克威(1290)+TX、弥拜菌素(557)+TX、米尔贝脲(别名)[CCN]+TX、丙胺氟磷(1293)+TX、灭蚁灵(1294)+TX、久效磷(561)+TX、茂硫磷(1300)+TX、莫西菌素(别名)[CCN]+TX、奈肽磷(别名)[CCN]+TX、二溴磷(567)+TX、萘(IUPAC/化学文摘名)(1303)+TX、NC-170(开发代码)(1306)+TX、NC-184(化合物代码)+TX、烟碱(578)+TX、烟碱硫酸盐(578)+TX、氟蚊灵(1309)+TX、烯啶虫胺(579)+TX、硝虫噻嗪(nithiazine)(1311)+TX、戊氰威(1313)+TX、戊氰威1:1氯化锌复合物(1313)+TX、NNI-0101(化合物代码)+TX、NNI-0250(化合物代码)+TX、降烟碱(惯用名)(1319)+TX、双苯氟脲(585)+TX、多氟脲(586)+TX、0-5-二氯-4-碘苯基O-乙基乙基硫代磷酸酯(IUPAC名称)(1057)+TX、0,0-二乙基O-4-甲基-2-氧代-2H-色烯-7-基硫代磷酸酯(IUPAC名称)(1074)+TX、0,0-二乙基O-6-甲基-2-丙基嘧啶-4-基硫代磷酸酯(IUPAC名称)(1075)+TX、0,0,0',0'-四丙基二硫代焦磷酸酯(IUPAC名称)(1424)+TX、油酸(IUPAC名称)(593)+TX、氧化乐果(594)+TX、草氨酰(602)+TX、砷吸磷(oxydemeton-methyl)(609)+TX、异亚砷磷(1324)+TX、砷拌磷(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、对二氯苯[CCN]+TX、对硫磷(615)+TX、对硫磷-甲基(616)+TX、氟幼脲(别名)[CCN]+TX、五氯苯酚(623)+TX、五氯苯基月桂酸酯(IUPAC名称)(623)+TX、苄氯菊酯(626)+TX、石油(别名)(628)+TX、PH 60-38(开发代码)(1328)+TX、酚硫磷(phenkapton)(1330)+TX、苯醚菊酯(630)+TX、稻丰散(631)+TX、甲拌磷(636)+TX、伏杀硫磷(637)+TX、硫环磷(1338)+TX、亚胺

硫磷(638)+TX、对氯硫磷(1339)+TX、磷胺(639)+TX、磷化氢(IUPAC名称)(640)+TX、辛硫磷(642)+TX、辛硫磷-甲基(1340)+TX、甲胺嘧磷(pirimetaphos)(1344)+TX、抗蚜威(651)+TX、乙基嘧啶磷(1345)+TX、甲基嘧啶磷(652)+TX、多氯二环戊二烯异构体(IUPAC名称)(1346)+TX、多氯萘烯(惯用名)(1347)+TX、亚砷酸钾[CCN]+TX、硫氰酸钾[CCN]+TX、炔丙菊酯(655)+TX、早熟素I(别名)[CCN]+TX、早熟素II(别名)[CCN]+TX、早熟素III(别名)[CCN]+TX、乙酰嘧啶磷(primidophos)(1349)+TX、丙溴磷(662)+TX、丙氟菊酯(profluthrin)[CCN]+TX、蜚虱威(1354)+TX、猛杀威(1355)+TX、丙虫磷(1356)+TX、胺丙畏(673)+TX、残杀威(678)+TX、乙噻唑磷(1360)+TX、丙硫磷(686)+TX、发果(1362)+TX、丙苯炔菊酯(protrifenbute)[CCN]+TX、吡蚜酮(688)+TX、吡啶硫磷(689)+TX、定菌磷(693)+TX、反灭虫菊(pyresmethrin)(1367)+TX、除虫菊酯I(696)+TX、除虫菊酯II(696)+TX、除虫菊酯(696)+TX、哒螨灵(699)+TX、啶虫丙醚(700)+TX、哒嗪硫磷(701)+TX、啶螨醚(706)+TX、啶硫磷(1370)+TX、蚊蝇醚(708)+TX、苦木(别名)[CCN]+TX、啶硫磷(711)+TX、啶硫磷-甲基(1376)+TX、畜宁磷(quinothion)(1380)+TX、啶硫磷(1381)+TX、R-1492(开发代码)(1382)+TX、碘醚柳胺(别名)[CCN]+TX、苜呋菊脂(719)+TX、鱼藤酮(722)+TX、RU 15525(开发代码)(723)+TX、RU 25475(开发代码)(1386)+TX、鱼尼丁(别名)(1387)+TX、利阿诺定(惯用名)(1387)+TX、藜芦碱(别名)(725)+TX、八甲磷(1389)+TX、克线丹(别名)+TX、司拉克丁(别名)[CCN]+TX、SI-0009(化合物代码)+TX、SI-0205(化合物代码)+TX、SI-0404(化合物代码)+TX、SI-0405(化合物代码)+TX、氟硅菊酯(728)+TX、SN 72129(开发代码)(1397)+TX、亚砷酸钠[CCN]+TX、氰化钠(444)+TX、氟化钠(IUPAC/化学文摘名)(1399)+TX、氟硅酸钠(1400)+TX、五氯酚钠(623)+TX、硒酸钠(IUPAC名称)(1401)+TX、硫氰酸钠[CCN]+TX、苏硫磷(1402)+TX、多杀菌素(737)+TX、螺甲螨酯(739)+TX、螺虫乙酯(spirotetmat)(CCN)+TX、sulcofuron(746)+TX、sulcofuron-sodium(746)+TX、氟虫胺(750)+TX、治螟磷(753)+TX、磺酰氟(756)+TX、硫丙磷(1408)+TX、焦油(别名)(758)+TX、氟胺氰菊酯(398)+TX、噻螨威(1412)+TX、TDE(1414)+TX、虫酰肼(762)+TX、吡螨胺(763)+TX、丁基嘧啶磷(764)+TX、氟苯脲(768)+TX、七氟菊酯(769)+TX、双硫磷(770)+TX、TEPP(1417)+TX、环戊烯丙菊酯(1418)+TX、叔丁威(别名)+TX、特丁磷(773)+TX、四氯乙烷[CCN]+TX、杀虫畏(777)+TX、胺菊酯(787)+TX、高效反式氯氰菊酯(204)+TX、噻虫啉(791)+TX、thiafenox(别名)+TX、噻虫嗪(792)+TX、噻氯磷(thicrofos)(1428)+TX、抗虫威(1431)+TX、杀虫环(798)+TX、杀虫环草酸盐(798)+TX、硫双威(799)+TX、久效威(800)+TX、甲基乙拌磷(801)+TX、虫线磷(1434)+TX、杀虫单(thiosultap)(803)+TX、杀虫双(thiosultap-sodium)(803)+TX、苏云金素(别名)[CCN]+TX、啉虫酰胺(809)+TX、四溴菊酯(812)+TX、四氟苯菊酯(813)+TX、transpermethrin(1440)+TX、三唑磷胺(1441)+TX、啉蚜威(818)+TX、三唑磷(820)+TX、triazuron(别名)+TX、敌百虫(824)+TX、trichlormetaphos-3(别名)[CCN]+TX、毒壤磷(1452)+TX、三氯丙氧磷(trifenofos)(1455)+TX、杀铃脲(835)+TX、混杀威(840)+TX、烯虫硫酯(1459)+TX、蚜灭多(847)+TX、氟吡啶虫(vaniliprole)[CCN]+TX、藜芦定(别名)(725)+TX、藜芦碱(别名)(725)+TX、XMC(853)+TX、灭杀威(854)+TX、YI-5302(化合物代码)+TX、 $\zeta$ -氯氰菊酯(205)+TX、zetamethrin(别名)+TX、磷化锌(640)+TX、zolaprofos(1469)和ZXI 8901(开发代码)(858)+TX、氰虫酰胺[736994-63-19]+TX、氯虫苯甲酰胺[500008-45-7]+TX、腈吡啶酯[560121-52-0]+TX、丁氟螨酯[400882-07-7]+TX、新啉啉(pyrifluquinazon)[337458-27-2]+TX、乙基多杀菌素[187166-40-1+187166-15-0]+

TX、螺虫乙酯[203313-25-1]+TX、虱虫啉[946578-00-3]+TX、丁虫脞[704886-18-0]+TX、氯氟醚菊酯[915288-13-0]+TX、四氟醚菊酯[84937-88-2]+TX、三氟苯嘧啶(triflumezopyrim)(披露于W0 2012/092115中)+TX、氟噁唑酰胺(fluxametamide)(W02007/026965)+TX、 $\epsilon$ -甲氧苄氟菊酯[240494-71-7]+TX、 $\epsilon$ -momfluorothrin[1065124-65-3]+TX、fluazaindolizine[1254304-22-7]+TX、氯碱丙炔菊酯[399572-87-3]+TX、fluxametamide[928783-29-3]+TX、氯氟氰虫酰胺(cyhalodiamide)[1262605-53-7]+TX、tioxazafen[330459-31-9]+TX、broflanilide[1207727-04-5]+TX、丁烯氟虫脞(flufiprole)[704886-18-0]+TX、环溴虫酰胺[1031756-98-5]+TX、氟氰虫酰胺[1229654-66-3]+TX、戊吡虫脞(描述于W0 2010/060231中)+TX、环氧虫啉(描述于W0 2005/077934中)+TX、Spiropidion+TX、Afidopyropen+Tx、flupyrimin+TX、Momfluorothrin+TX、 $\kappa$ -联苯菊酯+TX、 $\kappa$ -七氟菊酯+TX、Dichloromezotiaz+TX、Tetrachloraniliprole+TX、benzpyrimoxan+TX;

[0523] 杀软体动物剂,该杀软体动物剂选自由以下组成的物质组:二(三丁基锡)氧化物(IUPAC名称)(913)+TX、溴乙酰胺[CCN]+TX、砷酸钙[CCN]+TX、除线威(cloethocarb)(999)+TX、乙酰亚砷酸铜[CCN]+TX、硫酸铜(172)+TX、三苯锡(347)+TX、磷酸铁(IUPAC名称)(352)+TX、四聚乙醛(518)+TX、灭虫威(530)+TX、氯硝柳胺(576)+TX、氯硝柳胺乙醇胺盐(576)+TX、五氯酚(623)+TX、五氯苯氧化钠(623)+TX、噻螨威(tazimcarb)(1412)+TX、硫双威(799)+TX、三丁基氧化锡(913)+TX、杀螺吗啉(trifenmorph)(1454)+TX、混杀威(trimethacarb)(840)+TX、乙酸三苯基锡(IUPAC名称)(347)和三苯基氢氧化锡(IUPAC名称)(347)+TX、皮瑞普(pyriprole)[394730-71-3]+TX,

[0524] 杀线虫剂,所述杀线虫剂选自由以下组成的物质组:AKD-3088(化合物代码)+TX、1,2-二溴-3-氯丙烷(IUPAC/化学文摘名称)(1045)+TX、1,2-二氯丙烷(IUPAC/化学文摘名称)(1062)+TX、1,2-二氯丙烷与1,3-二氯丙烯(IUPAC名称)(1063)+TX、1,3-二氯丙烯(233)+TX、3,4-二氯四氢噻吩1,1-二氧化物(IUPAC/化学文摘名称)(1065)+TX、3-(4-氯苯基)-5-甲基罗丹宁(IUPAC名称)(980)+TX、5-甲基-6-硫代-1,3,5-噻二嗪烷-3-基乙酸(IUPAC名称)(1286)+TX、6-异戊烯基氨基嘌呤(别名)(210)+TX、阿维菌素(1)+TX、乙酰虫脞[CCN]+TX、棉铃威(15)+TX、涕灭威(aldicarb)(16)+TX、涕灭砷威(863)+TX、AZ 60541(化合物代码)+TX、苯氯噻唑(benclothiaz)[CCN]+TX、苯菌灵(62)+TX、丁基吡螨灵(别名)+TX、硫线磷(109)+TX、虫螨威(carbofuran)(118)+TX、二硫化碳(945)+TX、丁硫克百威(119)+TX、三氯硝基甲(141)+TX、毒死蜱(145)+TX、除线威(999)+TX、细胞分裂素(别名)(210)+TX、棉隆(216)+TX、DBCP(1045)+TX、DCIP(218)+TX、除线特(diamidafos)(1044)+TX、除线磷(1051)+TX、二克磷(dicliphos)(别名)+TX、乐果(262)+TX、多拉菌素(别名)[CCN]+TX、埃玛菌素(291)+TX、埃玛菌素苯甲酸盐(291)+TX、依立诺克丁(别名)[CCN]+TX、灭线磷(312)+TX、二溴化乙烯(316)+TX、克线磷(326)+TX、吡螨胺(fenpyrad)(别名)+TX、丰索磷(1158)+TX、噻唑磷(408)+TX、丁硫环磷(1196)+TX、糠醛(别名)[CCN]+TX、GY-81(开发代码)(423)+TX、速杀硫磷[CCN]+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、艾沙米多福(isamidofos)(1230)+TX、氯唑磷(1231)+TX、伊佛霉素(别名)[CCN]+TX、激动素(别名)(210)+TX、甲基减蚜磷(1258)+TX、威百亩(519)+TX、威百亩钾盐(别名)(519)+TX、威百亩钠盐(519)+TX、甲基溴(537)+TX、甲基异硫氰酸酯(543)+TX、米尔贝肟(别名)[CCN]+TX、莫昔克丁(别名)[CCN]+TX、疣孢漆斑菌

(*Myrothecium verrucaria*) 组合物(别名)(565)+TX、NC-184(化合物代码)+TX、草氨酰(602)+TX、甲拌磷(636)+TX、磷胺(639)+TX、磷虫威[CCN]+TX、克线丹(别名)+TX、司拉克丁(别名)[CCN]+TX、多杀菌素(737)+TX、叔丁威(别名)+TX、特丁磷(773)+TX、四氯噻吩(IUPAC/化学文摘名称)(1422)+TX、thiafenox(别名)+TX、硫磷嗪(1434)+TX、三唑磷(820)+TX、啉蚜威(别名)+TX、二甲苯酚[CCN]+TX、YI-5302(化合物代码)和玉米素(别名)(210)+TX、氟噻虫砜(fluensulfone)[318290-98-1]+TX、氟吡菌酰胺+TX

[0525] 硝化抑制剂,该硝化抑制剂选自由以下组成的物质组:乙基黄原酸钾[CCN]以及氯啉(nitrapyrin)(580)+TX,

[0526] 植物激活剂,该植物激活剂选自由以下组成的物质组:噻二唑素(acibenzolar)(6)+TX、噻二唑素-S-甲基(6)+TX、烯丙苯噻唑(probenazole)(658)和大虎杖(*Reynoutria sachalinensis*)提取物(别名)(720)+TX,

[0527] 杀鼠剂,该杀鼠剂选自由以下组成的物质组:2-异戊酰茛满-1,3-二酮(IUPAC名称)(1246)+TX、4-(喹啉-2-基氨基)苯磺酰胺(IUPAC名称)(748)+TX、 $\alpha$ -氯代醇[CCN]+TX、磷化铝(640)+TX、安妥(880)+TX、三氧化二砷(882)+TX、碳酸钡(891)+TX、双鼠脲(912)+TX、溴鼠隆(89)+TX、溴敌隆(91)+TX、溴鼠胺(92)+TX、氰化钙(444)+TX、氯醛糖(127)+TX、氯鼠酮(140)+TX、维生素D3(别名)(850)+TX、氯灭鼠灵(1004)+TX、克灭鼠(1005)+TX、杀鼠萘(175)+TX、杀鼠啉(1009)+TX、鼠得克(246)+TX、噻鼠灵(249)+TX、敌鼠钠(273)+TX、维生素D2(301)+TX、氟鼠灵(357)+TX、氟乙酰胺(379)+TX、鼠朴定(1183)+TX、盐酸鼠朴定(1183)+TX、 $\gamma$ -HCH(430)+TX、HCH(430)+TX、氢氰酸(444)+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、林旦(430)+TX、磷化镁(IUPAC名称)(640)+TX、溴甲烷(537)+TX、鼠特灵(1318)+TX、毒鼠磷(1336)+TX、磷化氢(IUPAC名称)(640)+TX、磷[CCN]+TX、杀鼠酮(1341)+TX、亚砷酸钾[CCN]+TX、灭鼠优(1371)+TX、海葱糖苷(1390)+TX、亚砷酸钠[CCN]+TX、氰化钠(444)+TX、氟乙酸钠(735)+TX、士的宁(745)+TX、硫酸铊[CCN]+TX、杀鼠灵(851)以及磷化锌(640)+TX,

[0528] 增效剂,该增效剂选自由以下组成的物质组:2-(2-丁氧基乙氧基)乙基胡椒基酯(IUPAC名称)(934)+TX、5-(1,3-苯并二氧杂环戊烯-5-基)-3-己基环己-2-烯酮(IUPAC名称)(903)+TX、具有橙花叔醇的法呢醇(别名)(324)+TX、MB-599(研究代码)(498)+TX、MGK 264(研究代码)(296)+TX、增效醚(piperonyl butoxide)(649)+TX、增效醛(piprotal)(1343)+TX、增效酯(propyl isomer)(1358)+TX、S421(研究代码)(724)+TX、增效散(sesamex)(1393)+TX、芝麻林素(sesasmolin)(1394)和亚砷(1406)+TX,

[0529] 动物驱避剂,该动物驱避剂选自由以下组成的物质组:葱醌(32)+TX、氯醛糖(127)+TX、环烷酸铜[CCN]+TX、王铜(171)+TX、二嗪磷(227)+TX、二环戊二烯(化学名称)(1069)+TX、双胍盐(guazatine)(422)+TX、双胍乙酸盐(422)+TX、灭虫威(530)+TX、吡啶-4-胺(IUPAC名称)(23)+TX、塞仑(804)+TX、混杀威(trimethacarb)(840)+TX、环烷酸锌[CCN]和福美锌(856)+TX,

[0530] 杀病毒剂,该杀病毒剂选自由以下组成的物质组:衣马宁(别名)[CCN]和利巴韦林(别名)[CCN]+TX,

[0531] 创伤保护剂,该创伤保护剂选自由以下组成的物质组:氧化汞(512)+TX、辛噻酮(octhilinone)(590)和甲基硫菌灵(802)+TX,

[0532] 以及生物活性化合物,这些化合物选自由以下物质组成的组:阿扎康唑(60207-



31-0)+TX、联苯三唑醇[70585-36-3]+TX、糠菌唑[116255-48-2]+TX、环丙唑醇[94361-06-5]+TX、苯醚甲环唑[119446-68-3]+TX、烯唑醇[83657-24-3]+TX、氟环唑[106325-08-0]+TX、腈苯唑[114369-43-6]+TX、氟唑唑[136426-54-5]+TX、氟硅唑[85509-19-9]+TX、粉唑醇[76674-21-0]+TX、己唑醇[79983-71-4]+TX、抑霉唑[35554-44-0]+TX、亚胺唑[86598-92-7]+TX、种菌唑[125225-28-7]+TX、叶菌唑[125116-23-6]+TX、腈菌唑[88671-89-0]+TX、稻瘟酯[101903-30-4]+TX、戊菌唑[66246-88-6]+TX、丙硫菌唑[178928-70-6]+TX、啉斑脒[88283-41-4]+TX、咪鲜胺[67747-09-5]+TX、丙环唑[60207-90-1]+TX、硅氟唑[149508-90-7]+TX、戊唑醇[107534-96-3]+TX、四氟醚唑[112281-77-3]+TX、三唑酮[43121-43-3]+TX、唑菌醇[55219-65-3]+TX、氟菌唑[99387-89-0]+TX、灭菌唑[131983-72-7]+TX、嘧啶醇[12771-68-5]+TX、氯苯嘧啶醇[60168-88-9]+TX、氟苯嘧啶醇[63284-71-9]+TX、乙嘧酚磺酸酯[41483-43-6]+TX、二甲嘧酚[5221-53-4]+TX、乙嘧酚[23947-60-6]+TX、吗菌灵[1593-77-7]+TX、苯锈啶[67306-00-7]+TX、丁苯吗啉[67564-91-4]+TX、螺环菌胺[118134-30-8]+TX、克啉菌[81412-43-3]+TX、嘧菌环胺[121552-61-2]+TX、嘧菌胺[110235-47-7]+TX、嘧霉胺[53112-28-0]+TX、拌种咯[74738-17-3]+TX、咯菌腈[131341-86-1]+TX、苯霜灵[71626-11-4]+TX、呋霜灵[57646-30-7]+TX、甲霜灵[57837-19-1]+TX、R-甲霜灵[70630-17-0]+TX、甲呋酰胺[58810-48-3]+TX、噁霜灵[77732-09-3]+TX、苯菌灵[17804-35-2]+TX、多菌灵[10605-21-7]+TX、咪菌威[62732-91-6]+TX、呋喃基苯并咪唑[3878-19-1]+TX、噻苯咪唑[148-79-8]+TX、乙菌利[84332-86-5]+TX、菌核利[24201-58-9]+TX、异菌脲[36734-19-7]+TX、甲菌利(myclozoline)[54864-61-8]+TX、腐霉利[32809-16-8]+TX、乙烯菌核利[50471-44-8]+TX、啉酰菌胺[188425-85-6]+TX、萎锈灵[5234-68-4]+TX、甲呋酰胺[24691-80-3]+TX、氟酰胺[66332-96-5]+TX、灭锈胺[55814-41-0]+TX、氧化萎锈灵[5259-88-1]+TX、吡噻菌胺[183675-82-3]+TX、噻呋酰胺[130000-40-7]+TX、双胍盐[108173-90-6]+TX、多果定[2439-10-3][112-65-2](游离碱)+TX、双胍辛胺[13516-27-3]+TX、腈嘧菌酯[131860-33-8]+TX、醚菌胺[149961-52-4]+TX、烯肟菌酯{格拉斯哥英国农作物保护委员会国际会议(Proc.BCPC,Int.Congr.,Glasgow,2003,1,93)}+TX、氟嘧菌酯[361377-29-9]+TX、醚菌酯(kresoxim-methyl)[143390-89-0]+TX、苯氧菌胺[133408-50-1]+TX、肟菌酯[141517-21-7]+TX、肟醚菌胺[248593-16-0]+TX、啉氧菌酯[117428-22-5]+TX、唑菌胺酯[175013-18-0]+TX、福美铁[14484-64-1]+TX、代森锰锌[8018-01-7]+TX、代森锰[12427-38-2]+TX、代森联[9006-42-2]+TX、甲基代森锌[12071-83-9]+TX、福美双[137-26-8]+TX、代森锌[12122-67-7]+TX、福美锌[137-30-4]+TX、敌菌丹[2425-06-1]+TX、克菌丹[133-06-2]+TX、抑菌灵[1085-98-9]+TX、唑呋草[41205-21-4]+TX、灭菌丹[133-07-3]+TX、对甲抑菌灵[731-27-1]+TX、波尔多混合剂[8011-63-0]+TX、氢氧化铜(copperhydroxid)[20427-59-2]+TX、王铜(copperoxychlorid)[1332-40-7]+TX、硫酸铜(coppersulfat)[7758-98-7]+TX、氧化铜(copperoxid)[1317-39-1]+TX、代森锰铜[53988-93-5]+TX、喹啉酮[10380-28-6]+TX、敌螨普[131-72-6]+TX、酞菌酯(nitrothal-isopropyl)[10552-74-6]+TX、克瘟散[17109-49-8]+TX、异稻瘟净(iprobenphos)[26087-47-8]+TX、稻瘟灵[50512-35-1]+TX、氯瘟磷[36519-00-3]+TX、定菌磷[13457-18-6]+TX、甲基立枯磷[57018-04-9]+TX、阿拉酸式苯-S-甲基[135158-54-2]+TX、敌菌灵[101-05-3]+TX、苯噻菌胺(benthiavalicarb)[413615-35-7]+TX、杀稻瘟菌素-S[2079-00-7]+TX、灭螨猛[2439-01-2]+TX、地茂散[2675-77-6]+TX、百菌

清[1897-45-6]+TX、环氟菌胺[180409-60-3]+TX、霜脲氰[57966-95-7]+TX、二氯萘醌[117-80-6]+TX、双氯氰菌胺[139920-32-4]+TX、哒菌酮[62865-36-5]+TX、氯硝胺[99-30-9]+TX、乙霉威[87130-20-9]+TX、烯酰吗啉[110488-70-5]+TX、SYP-LI90(氟吗啉)[211867-47-9]+TX、二噻农[3347-22-6]+TX、噻唑菌胺[162650-77-3]+TX、土菌灵[2593-15-9]+TX、噁唑酮菌[131807-57-3]+TX、咪唑菌酮[161326-34-7]+TX、稻瘟酰胺[115852-48-7]+TX、三苯锡[668-34-8]+TX、嘧菌胺[89269-64-7]+TX、氟啶胺[79622-59-6]+TX、氟吡菌胺[239110-15-7]+TX、磺菌胺[106917-52-6]+TX、环酰菌胺[126833-17-8]+TX、三乙膦酸铝[39148-24-8]+TX、噁霉灵[10004-44-1]+TX、丙森锌[140923-17-7]+TX、IKF-916(氰霜唑)[120116-88-3]+TX、春日霉素[6980-18-3]+TX、磺菌威[66952-49-6]+TX、苯菌酮[220899-03-6]+TX、戊菌隆[66063-05-6]+TX、四氯苯酞[27355-22-2]+TX、多氧霉素[11113-80-7]+TX、噻菌灵[27605-76-1]+TX、霜霉威[25606-41-1]+TX、丙氧喹啉[189278-12-4]+TX、咯唑酮[57369-32-1]+TX、喹氧灵[124495-18-7]+TX、五氯硝基苯[82-68-8]+TX、硫[7704-34-9]+TX、噻酰菌胺[223580-51-6]+TX、咪唑嗪[72459-58-6]+TX、三环唑[41814-78-2]+TX、噻胺灵[26644-46-2]+TX、井冈霉素[37248-47-8]+TX、苯酰菌胺(RH7281)[156052-68-5]+TX、双炔酰菌胺[374726-62-2]+TX、吡唑萘菌胺[881685-58-1]+TX、氟唑环菌胺[874967-67-6]+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸(9-二氯亚甲基-1,2,3,4-四氢-1,4-桥亚甲基-萘-5-基)-酰胺(披露于W02007/048556)+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸(3',4',5'-三氟-联苯-2-基)-酰胺(披露于W0 2006/087343)+TX、[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[(环丙基羰基)氧基]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氢-6,12-二羟基-4,6a,12b-三甲基-11-氧代-9-(3-吡啶基)-2H,11H萘并[2,1-b]吡喃并[3,4-e]吡喃-4-基]环丙烷甲酸甲酯[915972-17-7]+TX和1,3,5-三甲基-N-(2-甲基-1-氧丙基)-N-[3-(2-甲基丙基)-4-[2,2,2-三氟-1-甲氧基-1-(三氟甲基)乙基]苯基]-1H-吡唑-4-甲酰胺[926914-55-8]+TX; Lancotrione[1486617-21-3]+TX、氯氟吡啶酯[943832-81-3]+TX、ipfentrifluconazole[1417782-08-1]+TX、氯氟醚菌唑[1417782-03-6]+TX、quinofumelin[861647-84-9]+TX、右旋反式氯丙炔菊酯[399572-87-3]+TX、氯氟氰虫酰胺[1262605-53-7]+TX、三氟咪啶酰胺[1254304-22-7]+TX、fluxametamide[928783-29-3]+TX、ε-甲氧苄氟菊酯[240494-71-7]+TX、ε-momfluorothrin[1065124-65-3]+TX、氟唑菌酰羟胺(pydiflumetofen)[1228284-64-7]+TX、κ-联苯菊酯[439680-76-9]+TX、溴虫氟苯双酰胺(broflanilide)[1207727-04-5]+TX、dicloromezotiaz[1263629-39-5]+TX、dipymetitrone[16114-35-5]+TX、pyraziflumid[942515-63-1]+TX、和κ-七氟菊酯[391634-71-2]+TX;以及

[0533] 微生物,包括:鲁氏不动杆菌+TX、支顶孢属突起菌+TX+TX、支顶孢属头孢+TX+TX、支顶孢属柿(*Acremonium diospyri*)+TX、支顶孢属倒棍棒状的+TX、苹卷蛾颗粒体病毒属(*AdoxGV*) (**Capex®**)+TX、放射形土壤杆菌菌株K84(**Galltrol-A®**)+TX、交链格孢菌+TX、链格孢决明子+TX、链格孢属性(*Alternaria destruens*) (**Smolder®**)+TX、白粉寄生孢(**AQ10®**)+TX、黄曲霉AF36(**AF36®**)+TX、黄曲霉NRRL 21882(**Aflaguard®**)+TX、曲霉属+TX、出芽短梗霉菌+TX、固氮螺菌属+TX、(**MicroAZ®**+TX、TAZO**B®**)+TX、固氮菌属+TX、固氮菌属chroocuccum(**Azotomeal®**)+TX、固氮菌属囊肿(*Bionatural*

Blooming **Blossoms**®)+TX、解淀粉芽孢杆菌+TX、蜡样芽胞杆菌+TX、芽孢杆菌属菌株 (Bacillus chitinosporus strain)CM-1+TX、芽孢杆菌属菌株 (Bacillus chitinosporus strain AQ746+TX、地衣芽孢杆菌菌株HB-2 (Biostart™ **Rhizoboost**®)+TX、地衣芽孢杆菌菌株3086 (**EcoGuard**®)+TX、**Green Relief**®)+TX、B环状芽孢杆菌+TX、坚硬芽孢杆菌 (**BioSafe**®)+TX、BioNem-**WP**®)+TX、**VOTiVO**®)+TX、坚硬芽孢杆菌菌株I-1582+TX、巨大芽孢杆菌+TX、巨大芽孢杆菌+TX、巨大芽孢杆菌+TX、蕈状芽孢杆菌菌株AQ726+TX、乳头状瘤芽孢杆菌 (Milky Spore **Powder**®)+TX、短小芽孢杆菌属+TX、短小芽孢杆菌菌株GB34 (Yield**Shield**®)+TX、短小芽孢杆菌菌株AQ717+TX、短小芽孢杆菌菌株QST 2808 (**Sonata**®)+TX、**Ballad Plus**®)+TX、球形芽孢杆菌 (Bacillus spahericus) (**VectoLex**®)+TX、芽孢杆菌+TX、芽孢杆菌菌株AQ175+TX、芽孢杆菌菌株AQ177+TX、芽孢杆菌菌株AQ178+TX、枯草芽孢杆菌属菌株QST 713 (**CEASE**®)+TX、**Serenade**®)+TX、**Rhapsody**®)+TX、枯草芽孢杆菌属菌株QST 714 (**JAZZ**®)+TX、枯草芽孢杆菌属菌株AQ153+TX、枯草芽孢杆菌属菌株AQ743+TX、枯草芽孢杆菌属菌株QST3002+TX、枯草芽孢杆菌属菌株QST3004+TX、枯草芽孢杆菌属变种解淀粉芽孢杆菌菌株FZB24 (**Taegro**®)+TX、**Rhizopro**®)+TX、苏云金芽孢杆菌Cry2Ae+TX、苏云金芽孢杆菌Cry1Ab+TX、苏云金芽孢杆菌鳧泽亚种 (Bacillus thuringiensis aizawai)GC 91 (**Agree**®)+TX、苏云金芽孢杆菌以色列亚种 (Bacillus thuringiensis israelensis) (**BMP123**®)+TX、**Aquabac**®)+TX、**VectoBac**®)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种 (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、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种BMP 123 (**Baritone**®)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种HD-1 (Bioprotec-CAF/**3P**®)+TX、苏云金芽孢杆菌菌株BD#32+TX、苏云金芽孢杆菌菌株AQ52+TX、苏云金芽孢杆菌鳧泽变种 (Bacillus thuringiensis var. aizawai) (Xen**Tari**®)+TX、**DiPel**®)+TX、细菌属 (bacteria spp.) (**GROWMEND**®)+TX、**GROWSWEET**®)+TX、**Shootup**®)+TX、密执安棍状杆菌 (Clavipacter michiganensis)的噬菌体 (**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、白僵菌属 (Beauveria spp.)+TX、灰葡萄孢霉 (Botrytis cineria)+TX、大豆慢生型根瘤菌 (Bradyrhizobium japonicum) (**TerraMax**®)+TX、短短小芽孢杆菌 (Brevibacillus brevis)+TX、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种 (Bacillus thuringiensis tenebrionis) (**Novodor**®)+TX、BtBooster+TX、洋葱伯克霍尔德菌 (Burkholderia

cepacia) (**Deny®**+TX、**Intercept®**+TX、Blue **Circle®**)+TX、伯克霍尔德菌 (*Burkholderia gladii*)+TX、唐菖蒲伯克霍尔德菌 (*Burkholderia gladioli*)+TX、伯克霍尔德菌属 (*Burkholderia spp.*)+TX、加拿大蓟真菌 (*Canadian thistle fungus*) (**CBH Canadian Bioherbicide®**)+TX、奶酪假丝酵母 (*Candida butyri*)+TX、无名假丝酵母 (*Candida famata*)+TX、*Candida fructus*+TX、光滑念珠菌 (*Candida glabrata*)+TX、吉利蒙念珠菌 (*Candida guilliermondii*)+TX、口津假丝酵母 (*Candida melibiosica*)+TX、橄榄假丝酵母 (*Candida oleophila*) 菌株O+TX、近平滑假丝酵母 (*Candida parapsilosis*)+TX、菌膜假丝酵母 (*Candida pelliculosa*)+TX、铁红假丝酵母 (*Candida pulcherrima*)+TX、拉考夫假丝酵母 (*Candida reukaufii*)+TX、齐藤假丝酵母 (*Candida saitoana*) (**Bio-Coat®**+TX、**Biocure®**)+TX、清酒假丝酵母 (*Candida sake*)+TX、假丝酵母属 (*Candida spp.*)+TX、纤细假丝酵母 (*Candida tenuis*)+TX、戴氏西地西菌 (*Cedecea dravisae*)+TX、产黄纤维单胞菌 (*Cellulomonas flavigena*)+TX、螺卷毛壳 (*Chaetomium cochliodes*) (**Nova-Cide®**)+TX、球毛壳菌 (*Chaetomium globosum*) (**Nova-Cide®**)+TX、铁杉紫色杆菌 (*Chromobacterium subtsugae*) 菌株PRAA4-1T (**Grandevo®**)+TX、枝状枝孢菌 (*Cladosporium cladosporioides*)+TX、尖孢枝孢 (*Cladosporium oxysporum*)+TX、*Cladosporium chlorocephalum*+TX、枝孢属 (*Cladosporium spp.*)+TX、极细枝孢霉 (*Cladosporium tenuissimum*)+TX、粉红粘帚霉 (*Clonostachys rosea*) (**EndoFine®**)+TX、尖孢炭疽菌 (*Colletotrichum acutatum*)+TX、盾壳霉 (*Coniothyrium minitans*) (**Cotans WG®**)+TX、盾壳霉属 (*Coniothyrium spp.*)+TX、浅白隐球酵母 (*Cryptococcus albidus*) (**YIELDPLUS®**)+TX、土生隐球菌 (*Cryptococcus humicola*)+TX、*Cryptococcus infirmo-miniatus*+TX、罗伦隐球酵母 (*Cryptococcus laurentii*)+TX、苹果异形小卷蛾颗粒体病毒 (*Cryptophlebia leucotreta granulovirus*) (**Cryptex®**)+TX、坎平贪铜菌 (*Cupriavidus campinensis*)+TX、苹果蠹蛾颗粒体病毒 (*Cydia pomonella granulovirus*) (**CYD-X®**)+TX、苹果蠹蛾颗粒体病毒 (**Madex®**+TX、**Madex Plus®**+TX、**Madex Max/Carповirusine®**)+TX、*Cylindrobasidium laeve*+TX、枝双孢霉属 (*Cylindrocladium*)+TX、汉逊德巴利酵母 (*Debaryomyces hansenii*)+TX、*Drechslera hawaiiensis*+TX、阴沟肠杆菌 (*Enterobacter cloacae*)+TX、肠杆菌科 (*Enterobacteriaceae*)+TX、毒力虫霉 (*Entomophthora virulenta*) (**Vektor®**)+TX、黑附球菌 (*Epicoccum nigrum*)+TX、黑附球菌 (*Epicoccum purpurascens*)+TX、附球孢菌+TX、菌属 (*Filobasidium floriforme*)+TX、尖圭镰刀菌+TX、厚孢镰刀菌+TX、尖孢镰刀菌 (**Fusaclean®**/Biofox**C®**)+TX、层出镰孢+TX、镰刀菌+TX、白地霉 (*Galactomyces geotrichum*)+TX、胶枝霉属 (*Gliocladium catenulatum*) (**Primastop®**+TX、**Prestop®**)+TX、红粘帚霉+TX、胶枝霉属 (**SoilGard®**)+TX、绿粘帚霉 (**Soilgard®**)+TX、颗粒体病毒 (**Granupom®**)+TX、嗜盐盐芽孢杆菌 (*Halobacillus halophilus*)+

TX、沿岸盐芽孢杆菌 (*Halobacillus litoralis*) +TX、特氏盐芽孢杆菌 (*Halobacillus trueperi*) +TX、盐单胞菌属 +TX、冰下盐单胞菌 (*Halomonas subglaciescola*) +TX、盐弧菌变型 (*Halovibrio variabilis*) +TX、葡萄汁有孢汉逊酵母 +TX、棉铃虫核型多角体病毒 (**Helicovex®**) +TX、玉米穗虫核型多角体病毒 (**Gemstar®**) +TX、异黄酮-芒柄花黄素 (**Myconate®**) +TX、柠檬克勒克酵母 +TX、克勒克酵母属 +TX、大链壶菌 (*Lagenidium giganteum*) (**Laginex®**) +TX、长孢蜡蚧菌 (*Lecanicillium longisporum*) (**Vertiblast®**) +TX、蜡蚧轮枝菌 (*Lecanicillium muscarium*) (**Vertikil®**) +TX、舞毒蛾核多角体病毒 (**Disparvirus®**) +TX、嗜盐海球菌 +TX、格氏梅拉菌 (*Meira geulakonigii*) +TX、绿僵菌 (**Met52®**) +TX、绿僵菌 (*Destruxin WP®*) +TX、*Metschnikowia fruticola* (**Shemer®**) +TX、美极梅奇酵母 (*Metschnikowia pulcherrima*) +TX、*Microdochium dimerum* (**Antibot®**) +TX、蓝色小单孢菌 (*Micromonospora coerulea*) +TX、*Microsphaeropsis ochracea* +TX、*Muscodor albus* 620 (**Muscudor®**) +TX、*Muscodor roseus* 菌株 A3-5 +TX、菌根属 (*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、粉质拟青霉 (*Paecilomyces farinosus*) +TX、玫烟色拟青霉 (**PFR-97®** +TX、**PreFeRal®**) +TX、淡紫拟青霉 (*Paecilomyces lilacinus*) (*Biostat WP®*) +TX、淡紫拟青霉菌株 251 (**MeloCon WG®**) +TX、多粘类芽孢杆菌 +TX、成团泛菌 (**BlightBan C9-1®**) +TX、泛菌属 +TX、巴斯德氏芽菌属 (**Econem®**) +TX、*Pasteuria nishizawae* +TX、黄灰青霉 +TX、*Penicillium billai* (**Jumpstart®** +TX、**TagTeam®**) +TX、短密青霉 +TX、常现青霉 +TX、灰黄青霉 +TX、产紫青霉 +TX、青霉菌属 +TX、纯绿色青霉 +TX、大伏革菌 (*Phlebiopsis gigantea*) (**Rotstop®**) +TX、解磷细菌 (**Phosphomeal®**) +TX、隐地疫霉 +TX、棕榈疫霉 (**Devine®**) +TX、异常毕赤酵母 +TX、*Pichia guilhermondii* +TX、膜醭毕赤氏酵母 +TX、指甲毕赤酵母 +TX、树干毕赤酵母 +TX、铜绿假单胞菌 +TX、致金色假单胞菌 (*Pseudomonas aureofasciens*) (*Spot-Less Biofungicide®*) +TX、洋葱假单胞菌 +TX、绿针假单胞菌 (**AtEze®**) +TX、皱褶假单胞菌 (*Pseudomonas corrugate*) +TX、荧光假单胞菌菌株 A506 (**BlightBan A506®**) +TX、恶臭假单胞菌 +TX、*Pseudomonas reactans* +TX、假单胞菌属 +TX、丁香假单胞菌 (**Bio-Save®**) +TX、绿黄假单胞菌 +TX、荧光假单胞菌 (**Zequanox®**) +TX、*Pseudozyma flocculosa* 菌株 PF-A22 UL (**Sporodex L®**) +TX、纵沟柄锈菌 (*Puccinia canaliculata*) +TX、*Puccinia thlaspeos* (**Wood Warrior®**) +TX、侧雄腐霉菌 (*Pythium oligandrum*) +TX、寡雄腐霉 (**Polygandron®** +TX、**Polyversum®**) +TX、缠器腐霉 +TX、水生拉恩菌 (*Rhanelia aquatilis*) +TX、拉恩菌属 (*Rhanelia spp.*) +TX、根瘤菌 (*Rhizobia*)

(**Dormal®**+TX、**Vault®**)+TX、丝核菌属(Rhizoctonia)+TX、球状红球菌(Rhodococcus globerulus)菌株AQ719+TX、双倒卵形红冬孢酵母菌(Rhodosporidium diobovatum)+TX、圆红冬孢酵母菌(Rhodosporidium toruloides)+TX、红酵母属(Rhodotorula spp.)+TX、粘红酵母(Rhodotorula glutinis)+TX、禾本红酵母(Rhodotorula graminis)+TX、胶红酵母(Rhodotorula mucilagnosa)+TX、深红酵母(Rhodotorula rubra)+TX、酿酒酵母(Saccharomyces cerevisiae)+TX、玫瑰色盐水球菌(Salinococcus roseus)+TX、小核盘菌(Sclerotinia minor)+TX、小核盘菌(**SARRITOR®**)+TX、柱顶孢霉属(Scytalidium spp.)+TX、Scytalidium uredinicola+TX、甜菜夜蛾核型多角体病毒(Spodoptera exigua nuclear polyhedrosis virus) (**Spod-X®**+TX、**Spexit®**)+TX、粘质沙雷氏菌(Serratia marcescens)+TX、普城沙雷菌(Serratia plymuthica)+TX、沙雷氏菌属(Serratia spp.)+TX、粪生粪壳菌(Sordaria fimicola)+TX、海灰翅夜蛾核型多角体病毒(Spodoptera littoralis nucleopolyhedrovirus) (**Littovir®**)+TX、红掷孢酵母(Sporobolomyces roseus)+TX、嗜麦芽寡养单胞菌(Stenotrophomonas maltophilia)+TX、不吸水链霉菌(Streptomyces ahygroscopicus)+TX、白丘链霉菌(Streptomyces albaduncus)+TX、脱叶链霉菌(Streptomyces exfoliates)+TX、鲜黄链霉菌(Streptomyces galbus)+TX、灰平链霉菌(Streptomyces griseoplanus)+TX、灰绿链霉菌(Streptomyces griseoviridis) (**Mycostop®**)+TX、利迪链霉菌(Streptomyces lydicus) (**Actinovate®**)+TX、利迪链霉菌WYEC-108 (**ActinoGrow®**)+TX、紫色链霉菌(Streptomyces violaceus)+TX、小铁艾酵母(Tilletiopsis minor)+TX、铁艾酵母属(Tilletiopsis spp.)+TX、棘孢木霉(Trichoderma asperellum) (T34**Biocontrol®**)+TX、盖姆斯木霉(Trichoderma gamsii)+TX、深绿木霉(Trichoderma atroviride) (**Plantmate®**)+TX、钩状木霉(Trichoderma hamatum) TH 382+TX、里法哈茨木霉(Trichoderma harzianum rifai) (**Mycostar®**)+TX、哈茨木霉(Trichoderma harzianum) T-22 (**Trianium-P®**+TX、PlantShield **HC®**+TX、**RootShield®**+TX、**Trianium-G®**)+TX、哈茨木霉(Trichoderma harzianum) T-39(**Trichodex®**)+TX、非钩木霉(Trichoderma inhamatum)+TX、康宁木霉(Trichoderma koningii)+TX、木霉属(Trichoderma spp.) LC 52(**Sentinel®**)+TX、木素木霉(Trichoderma lignorum)+TX、长柄木霉(Trichoderma longibrachiatum)+TX、多孢木霉(Trichoderma polysporum) (Binab **T®**)+TX、紫杉木霉(Trichoderma taxi)+TX、绿色木霉(Trichoderma virens)+TX、绿色木霉(原来称为绿色粘帚霉(Gliocladium virens) GL-21) (**SoilGuard®**)+TX、绿色木霉(Trichoderma viride)+TX、绿色木霉菌株ICC 080(**Remedier®**)+TX、茁芽丝孢酵母(Trichosporon pullulans)+TX、毛孢子菌属(Trichosporon spp.)+TX、单端孢属(Trichothecium spp.)+TX、粉红单端孢(Trichothecium roseum)+TX、Typhula phacorrhiza菌株94670+TX、Typhula phacorrhiza菌株94671+TX、黑细基格孢(Ulocladium atrum)+TX、奥德曼细基格孢(Ulocladium oudemansii) (**Botry-Zen®**)+TX、玉蜀黍黑粉

菌 (*Ustilago maydis*) +TX、各种细菌和补充营养素 (**Natural II®**) +TX、各种真菌 (**Millennium Microbes®**) +TX、厚垣轮枝孢菌 (*Verticillium chlamyosporium*) +TX、蜡蚧轮枝菌 (*Verticillium lecanii*) (**Mycotal®** +TX、**Vertalec®**) +TX、**Vip3Aa20 (VIPTera®)** +TX、*Virgibacillus marismortui* +TX、野油菜黄单胞菌 (*Xanthomonas campestris* pv. *Poae*) (**Camperico®**) +TX、伯氏致病杆菌 +TX、嗜线虫致病杆菌；并且

[0534] 植物提取物, 包括: 松树油 (**Retenol®**) +TX、印楝素 (**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、土荆芥 (*Chenopodium ambrosioides* near *ambrosioides*) (**Requiem®**) +TX、菊花提取物 (**Crisant®**) +TX、印楝油提取物 (**Trilogy®**) +TX、唇形科 (*Labiatae*) 精油 (**Botania®**) +TX、丁香-迷迭香-薄荷和百里香油提取物 (**Garden insect killer®**) +TX、甜菜碱 (**Greenstim®**) +TX、大蒜 +TX、柠檬草油 (**GreenMatch®**) +TX、印楝油 +TX、猫薄荷 (*Nepeta cataria*) (猫薄荷油) +TX、猫薄荷 +TX、尼古丁 +TX、牛至油 (**MossBuster®**) +TX、胡麻科 (*Pedaliaceae*) 油 (**Nematon®**) +TX、除虫菊 +TX、皂皮树 (*Quillaja saponaria*) (**NemaQ®**) +TX、大虎杖 (*Reynoutria sachalinensis*) (**Regalia®** +TX、**Sakalia®**) +TX、鱼藤酮 (**Eco Roten®**) +TX、芸香科 (*Rutaceae*) 植物提取物 (**Soleo®**) +TX、大豆油 (**Ortho ecosense®**) +TX、茶树油 (**Timorex Gold®**) +TX、百里香油 +TX、**AGNIQUE®** MMF +TX、**BugOil®** +TX、迷迭香-芝麻-胡椒薄荷-百里香和肉桂提取物混合物 (**EF 300®**) +TX、丁香-迷迭香和薄荷提取物混合物 (**EF 400®**) +TX、丁香-胡椒薄荷-大蒜油和薄荷混合物 (**Soil Shot®**) +TX、高岭土 (**Screen®**) +TX、褐藻的贮存葡聚糖 (**Laminarin®**) ; 并且

[0535] 信息素, 包括: 黑头萤火虫信息素 (**3M Sprayable Blackheaded Fireworm Pheromone®**) +TX、苹果蠹蛾信息素 (**Paramount dispenser- (CM)/Isomate C-Plus®**) +TX、葡萄小卷叶蛾信息素 (**3M MEC-GBM Sprayable Pheromone®**) +TX、卷叶虫信息素 (**3M MEC-LR Sprayable Pheromone®**) +TX、家蝇信息素 (**Muscamone**) (**Snip7 Fly Bait®**) +TX、**Starbar Premium Fly Bait®**) +TX、梨小食心虫信息素 (**3M oriental fruit moth sprayable pheromone®**) +TX、桃透翅蛾 (*Peachtree Borer*) 信息素 (**Isomate-P®**) +TX、番茄蠹蛾 (*Tomato Pinworm*) 信息素 (**3M Sprayable pheromone®**) +TX、衣透斯特粉末 (**Entostat powder**) (棕榈树提取物) (**Exosex CM®**) +TX、(E+TX, Z+TX, Z) -3+TX, 8+TX, 11+TX, 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-醇乙酸酯 +TX、2-甲基-1-丁醇 +TX、乙酸钙 +TX、**Scenturion®** +TX、**Biolure®** +TX、**Check-Mate®** +TX、薰衣草千里酸酯

(Lavandulyl senecioate);并且

[0536] 宏生物剂 (Macrobial), 包括:短距蚜小蜂+TX、阿尔蚜茧蜂 (*Aphidius ervi*) (**Aphelinus-System®**) +TX、*Acerophagus papaya*+TX、二星瓢虫 (**Adalia-System®**) +TX、二星瓢虫 (**Adaline®**) +TX、二星瓢虫 (**Aphidalia®**) +TX、串茧跳小蜂 (*Ageniaspis citricola*) +TX、巢蛾多胚跳小蜂+TX、安氏钝绥螨 (*Amblyseius andersoni*) (**Anderline®**+TX、**Andersoni-System®**) +TX、加州钝绥螨 (*Amblyseius californicus*) (**Amblyline®**+TX、**Spical®**) +TX、胡瓜钝绥螨 (**Thripex®**+TX、**Bugline cucumeris®**) +TX、伪钝绥螨 (**Fallacis®**) +TX、斯氏钝绥螨 (*Bugline swirskii*) +TX、**Swirskii-Mite®**) +TX、奥氏钝绥螨 (**WomerMite®**) +TX、粉虱细蜂 (*Amitus hesperidum*) +TX、原缨翅小蜂 (*Anagrus atomus*) +TX、暗腹长索跳小蜂 (*Anagrus fusciventris*) +TX、卡玛长索跳小蜂 (*Anagrus kamali*) +TX、*Anagrus loeckii*+TX、粉蚧长索跳小蜂 (*Anagrus pseudococci*) (**Citripar®**) +TX、红蜡蚧扁角跳小蜂 (*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、科列马·阿布拉小蜂 (*Aphidius colemani*) (**Ahipar®**) +TX、阿尔蚜茧蜂 (**Ervipar®**) +TX、烟蚜茧蜂+TX、桃赤蚜蚜茧蜂 (**Ahipar-M®**) +TX、食蚜瘿蚊 (**Aphidend®**) +TX、食蚜瘿蚊 (**Aphidoline®**) +TX、岭南蚜小蜂+TX、印巴黄金蚜小蜂+TX、蠟卵长尾啮小蜂 (*Aprostocetus hagenowii*) +TX、隐翅虫 (*Atheta coriaria*) (**Staphyline®**) +TX、熊蜂属+TX、欧洲熊蜂 (*Natupol* **Beehive®**) +TX、欧洲熊蜂 (**Beeline®**+TX、**Tripol®**) +TX、*Cephalonomia stephanoderis*+TX、黑背红瓢虫 (*Chilocorus nigritus*) +TX、普通草蛉 (*Chrysoperla carnea*) (**Chrysoline®**) +TX、普通草蛉 (**Chrysopa®**) +TX、红通草蛉 (*Chrysoperla rufilabris*) +TX、*Cirrospilus ingenuus*+TX、*Cirrospilus quadristriatus*+TX、白星橘啮小蜂 (*Citrostichus phyllocnistoides*) +TX、*Closterocerus chamaeleon*+TX、*Closterocerus*属+TX、*Coccidoxenoides perminutus* (**Planopar®**) +TX、*Coccophagus cowperi*+TX、赖食蚧蚜小蜂 (*Coccophagus lycimnia*) +TX、螟黄足盘绒茧蜂+TX、菜蛾盘绒茧蜂+TX、孟氏隐唇瓢虫 (**Cryptobug®**+TX、**Cryptoline®**) +TX、日本方头甲+TX、西伯利亚离颚茧蜂+TX、西伯利亚离颚茧蜂 (**Minusa®**) +TX、豌豆潜蝇姬小蜂 (**Diminex®**) +TX、小黑瓢虫 (*Delphastus catalinae*) (**Delphastus®**) +TX、*Delphastus pusillus*+TX、*Diachasmimorpha krausii* +TX、长尾潜蝇茧蜂+TX、*Diaparsis jucunda*+TX、阿里食虱跳小蜂 (*Diaphorencyrtus*



aligarhensis)+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂 (**Miglyphus®**)+TX、**Digline®**)+TX、西伯利亚离颚茧蜂 (**DacDigline®**)+TX、**Minex®**)+TX、歧脉跳小蜂属+TX、盾蚧长缨蚜小蜂+TX、丽蚜小蜂 (*Encarsia max®*)+TX、**Encarline®**)+TX、**En-Strip®**)+TX、浆角蚜小蜂 (*Eretmoceris eremicus*) (**Enermix®**)+TX、哥德恩蚜小蜂 (*Encarsia guadeloupeae*)+TX、海地恩蚜小蜂 (*Encarsia haitiensis*)+TX、细扁食蚜蝇 (**Syrphidend®**)+TX、*Eretmoceris siphonini*+TX、浆角蚜小蜂 (*Eretmoceris californicus*)+TX、浆角蚜小蜂 (*Eretmoceris eremicus*) (**Ercal®**)+TX、**Eretline e®**)+TX、浆角蚜小蜂 (*Eretmoceris eremicus*) (**Bemimix®**)+TX、海氏浆角蚜小蜂+TX、蒙氏浆角蚜小蜂 (**Bemipar®**)+TX、**Eretline m®**)+TX、*Eretmoceris siphonini*+TX、四斑光缘瓢虫 (*Exochomus quadripustulatus*)+TX、食螨瘿蚊 (*Feltiella acarisuga*) (**Spidend®**)+TX、食螨瘿蚊 (**Feltiline®**)+TX、阿里山潜蝇茧蜂+TX、*Fopius ceratitivorus*+TX、芒柄花黄素 (*Wirless Beehome®*)+TX、细腰凶蓟马 (**Vespop®**)+TX、西方静走螨 (*Galendromus occidentalis*)+TX、莱氏棱角肿腿蜂 (*Goniozus legneri*)+TX、麦蛾柔茧蜂+TX、异色瓢虫 (**HarmoBeetle®**)+TX、异小杆线虫属 (**Lawn Patrol®**)+TX、嗜菌异小杆线虫 (*NemaShield HB®*)+TX、**Nemaseek®**)+TX、**Terranem-Nam®**)+TX、**Terranem®**)+TX、**Larvanem®**)+TX、**B-Green®**)+TX、**NemAttack®**)+TX、**Nematop®**)+TX、大异小杆线虫 (*Heterorhabditis megidis*) (**Nemasys H®**)+TX、**BioNem H®**)+TX、**Exhibitline hm®**)+TX、**Larvanem-M®**)+TX、集栖瓢虫 (*Hippodamia convergens*)+TX、尖狭下盾螨 (*Hypoaspis aculeifer*) (**Aculeifer-System®**)+TX、**Entomite-A®**)+TX、兵下盾螨 (*Hypoaspis miles*) (**Hypoline m®**)+TX、**Entomite-M®**)+TX、黑色枝跗瘿蜂+TX、*Lecanoideus floccissimus*+TX、*Lemophagus errabundus*+TX、三色丽突跳小蜂 (*Leptomastidea abnormis*)+TX、*Leptomastix dactylopii* (**Leptopar®**)+TX、长角跳小蜂 (*Leptomastix epona*)+TX、*Lindorus lophanthae*+TX、*Lipolexis oregmae*+TX、叉叶绿蝇 (**Natufly®**)+TX、茶足柄瘤蚜茧蜂+TX、暗黑长脊盲蝽 (*Macrolophus caliginosus*) (**Mirical-N®**)+TX、**Macroline c®**)+TX、**Mirical®**)+TX、*Mesoseiulus longipes*+TX、黄色阔柄跳小蜂 (*Metaphycus flavus*)+TX、*Metaphycus lounsburyi*+TX、角纹脉褐蛉 (**Milacewing®**)+TX、黄色花翅跳小蜂 (*Microterys flavus*)+TX、*Muscidifurax raptorellus*和*Spalangia cameroni* (**Biopar®**)+TX、*Neodryinus typhlocybae*+TX、加州新小绥螨+TX、胡瓜钝绥螨 (**THRYPEX®**)+TX、虚伪新小绥螨 (*Neoseiulus fallacis*)+TX、*Nesideocoris tenuis* (**NesidioBug®**)+TX、**Nesibug®**)+TX、古铜黑蝇 (**Biofly®**)+TX、狡小花蝽 (*Orius*

insidiosus) (**Thripor-I®**+TX、Oriline **i®**) +TX、无毛小花蝽 (*Orius laevigatus*) (**Thripor-L®**+TX、Oriline **l®**) +TX、大型小花蝽 (*Orius majusculus*) (Oriline **m®**) +TX、小黑花椿象 (**Thripor-S®**) +TX、*Pauesia juniperorum*+TX、酸酱瓢虫腹柄姬小蜂 (*Pediobius foveolatus*) +TX、*Phasmarhabditis hermaphrodita* (**Nemaslug®**) +TX、*Phymastichus coffea*+TX、*Phytoseiulus macropilus*+TX、智利小植绥螨 (**Spidex®**+TX、*Phytoline p®*) +TX、斑腹刺益蝽 (**Podisus®**) +TX、*Pseudacteon curvatus*+TX、*Pseudacteon obtusus*+TX、*Pseudacteon tricuspis*+TX、*Pseudaphycus maculipennis*+TX、*Pseudleptomastix mexicana*+TX、具毛嗜木虱跳小蜂 (*Psyllaephagus pilosus*) +TX、同色短背茧蜂 (*Psytalia concolor*) (complex) +TX、胯姬小蜂属+TX、*Rhyzobius lophanthae*+TX、澳洲瓢虫+TX、*Rumina decollate*+TX、*Semielacher petiolatus*+TX、麦长管蚜 (**Ervibank®**) +TX、小卷蛾斯氏线虫 (*Nematac C®*+TX、**Millenium®**+TX、**BioNem C®**+TX、**NemAttack®**+TX、**Nemastar®**+TX、**Capsanem®**) +TX、夜蛾斯氏线虫 (**NemaShield®**+TX、*Nemasys F®*+TX、**BioNemF®**+TX、**Steinernema-System®**+TX、**NemAttack®**+TX、**Nemaplus®**+TX、*Exhibitline sf®*+TX、**Scia-rid®**+TX、**Entonem®**) +TX、锯蜂线虫 (*Steinernema kraussei*) (*Nemasys L®*+TX、**BioNemL®**+TX、*Exhibitline srb®*) +TX、里奥布拉夫线虫 (*Steinernema riobrave*) (**BioVector®**+TX、**BioVektor®**) +TX、蝼蛄斯氏线虫 (*Steinernema scapterisci*) (*Nematac S®*) +TX、斯氏线虫属+TX、*Steinernematid*属 (**Guardian Nematodes®**) +TX、深点食螨瓢虫 (**Stethorus®**) +TX、亮腹釉小蜂+TX、*Tetrastichus setifer*+TX、*Thripobius semiluteus*+TX、中华长尾小蜂 (*Torymus sinensis*) +TX、甘蓝夜蛾赤眼蜂 (*Tricholine b®*) +TX、甘蓝夜蛾赤眼蜂 (**Tricho-Strip®**) +TX、广赤眼蜂+TX、微小赤眼蜂+TX、玉米螟赤眼蜂+TX、宽脉赤眼蜂 (*Trichogramma platneri*) +TX、短管赤眼蜂+TX、螟黑点瘤姬蜂；并且

[0537] 其他生物制剂，包括：脱落酸+TX、**bioSea®**+TX、银叶菌 (*Chondrostereum purpureum*) (**Chontrol Paste®**) +TX、盘长孢状刺盘孢 (**Collego®**) +TX、辛酸铜盐 (**Cueva®**) +TX、 $\delta$ 陷阱 (Delta trap) (**Trapline d®**) +TX、解淀粉欧文氏菌 (*Harpin*) (**ProAct®**+TX、Ni-HIBIT Gold **CST®**) +TX、磷酸高铁 (**Ferramol®**) +TX、漏斗陷阱 (**Trapline y®**) +TX、**Gallex®**+TX、**Grower's Secret®**+TX、高油菜素内酯+TX、磷酸铁 (*Lilly Miller Worry Free Ferramol Slug&Snail Bait®*) +TX、MCP冰雹陷阱 (**Trapline f®**) +TX、*Microctonus hyperodae*+TX、*Mycoleptodiscus terrestris* (**Des-X®**) +TX、**BioGain®**+TX、**Aminomite®**+TX、**Zenox®**+TX、信息素陷阱 (**Thripline ams®**) +TX、碳酸氢钾 (**MilStop®**) +TX、脂肪酸的钾盐 (**Sanova®**) +TX、硅酸钾溶液 (**Sil-Matrix®**) +TX、碘化钾+硫氰酸钾 (**Enzicur®**) +TX、**SuffOil-X®**+TX、蜘蛛毒+

TX、蝗虫微孢子虫 (Semaspore Organic Grasshopper **Control**®)+TX、粘着陷阱 (Trapline **YF**®)+TX、Rebell **Amarillo**®)+TX以及陷阱 (Takitrapline y+**b**®)+TX;

[0538] 或选自以下的生物活性化合物或试剂:溴氟菊酯+TX、氟螨嗪 (Diflovidazine)+TX、Flometoquin+TX、Fluhexafon+TX、小菜蛾颗粒体病毒+TX、苹果蠹蛾颗粒体病毒+TX、新烟磷 (Imicyafos)+TX、烟芽夜蛾核多角体病毒+TX、Heliothis punctigera核多角体病毒+TX、玉米穗夜蛾核多角体病毒+TX、草地贪夜蛾核多角体病毒+TX、小菜蛾核多角体病毒+TX、对伞花炔+TX、Pyflubumide+TX、Pyrafluprole+TX、QRD 420+TX、QRD 452+TX、QRD 460+TX、萘类混合物+TX、萘类+TX、氟氰虫酰胺 (Tetraniliprole)+TX和 $\alpha$ -萘品烯+TX;

[0539] 或由如下代码+TX提及的活性物质:代码AE 1887196 (BSC-BX60309)+TX、代码NNI-0745GR+TX、代码IKI-3106+TX、代码JT-L001+TX、代码ZNQ-08056+TX、代码IPPA152201+TX、代码HNPC-A9908 (CAS: [660411-21-2])+TX、代码HNPC-A2005 (CAS: [860028-12-2])+TX、代码JS118+TX、代码ZJ0967+TX、代码ZJ2242+TX、代码JS7119 (CAS: [929545-74-4])+TX、代码SN-1172+TX、代码HNPC-A9835+TX、代码HNPC-A9955+TX、代码HNPC-A3061+TX、代码Chuanhua 89-1+TX、代码IPP-10+TX、代码ZJ3265+TX、代码JS9117+TX、代码ZJ3757+TX、代码ZJ4042+TX、代码ZJ4014+TX、代码ITM-121+TX、代码DPX-RAB55 (DKI-2301)+TX、代码NA-89+TX、代码MIE-1209+TX、代码MCI-8007+TX、代码BCS-CL73507+TX、代码S-1871+TX、代码DPX-RDS63+TX、Quinofumelin+TX、氯氟醚菌唑+TX、苯吡克咪德 (fepicoxamid)+TX、fluindapyr+TX、inpyrfluxam+TX或indiflumetpyr+TX、isoflucypram+TX、pyrapropoyne+TX、florylpicoxamid+TX、metyltetraprole+TX、ipflufenquin+TX、pyridachlometyl+TX或chlopyridiflu+TX、四氯虫酰胺 (tetrachlorantraniliprole)+TX、tetrachloraniliprole+TX、Tyclopyrazoflor+TX、flupyrimin+TX或pyrifluramide+TX、benzpyrimoxan+TX、Benzosufyl+TX或oxazosulfyl+TX、乙唑螨腈 (etpyrafen)+TX、acynonapyr+TX或pyrinonafen+TX、氧代三酮 (oxotrione)+TX、bixlozone+TX或clofendizone+TX或dicloroxizone+TX、cyclopyranil+TX或pyrazocyclonil+TX或cyclopyrazonil+TX、 $\alpha$ -溴敌隆+TX和代码AKD-1193+TX。

[0540] 在活性成分之后的括号中的参考,例如[3878-19-1]是指化学文摘登记号。上文描述的混合配伍物是已知的。当活性成分包括在“The Pesticide Manual[杀有害生物剂手册]”[The Pesticide Manual-AWorld Compendium[杀有害生物剂手册-全球概览];第13版;编辑:C.D.S.TomLin;The British Crop Protection Coimcil[英国农作物保护委员会]]中,它们在其中以上文对于特定化合物的圆括号中所给出的条目编号来描述;例如化合物“阿巴美丁”以条目编号(1)来描述。其中“[CCN]”是对于上文的特定化合物来加上的,该化合物包括在“Compendium of Pesticide Common Names[农药通用名概要]”中,其可以在互联网[A.Wood;Compendium of Pesticide Common Names, Copyright ©1995-2004]上获得;例如,化合物“乙酰虫腈”描述于互联网地址<http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>中。

[0541] 多数以上描述的活性成分通过上文中所谓的“通用名”来表示,在不同的情形中使用相应的“ISO通用名”或其它“通用名”。若名称不是“通用名”,则所使用的名称种类以特定化合物的圆括号中所给出的名称来代替;在这种情况下,使用IUPAC名称、IUPAC/化学文摘名、“化学名称”、“惯用名”、“化合物名称”或“开发代码”,或若既不使用那些名称之一也不

使用“通用名”，则使用“别名”。“CAS登记号”意指化学文摘登记号。

[0542] 选自表1至表12和表P的具有式I的化合物与上述活性成分的活性成分混合物包含选自表1至表12和表P的化合物和如上所述的活性成分，它们优选地处于从100:1至1:6000，尤其是从50:1至1:50的混合比，更尤其是处于从20:1至1:20的比率，甚至更特别是从10:1至1:10，非常特别是从5:1至1:5，特别优选的从2:1至1:2的比率，同样优选的是从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。那些混合比率是按重量计的。

[0543] 如上所述的混合物可以被用于控制有害生物的方法中，该方法包括将含如上所述的混合物的组合物施用于有害生物或其环境中，通过手术或疗法用于处理人或动物体的方法以及在人或动物体上实施的诊断方法除外。

[0544] 包含选自表1至12和表P的具有式I的化合物以及一种或多种如上文所述的活性成分的混合物可以例如以单一的“掺水即用”的形式施用，以组合的喷雾混合物（该混合物由这些单一活性成分的单独配制品构成）（例如“桶混制剂”）施用，并且当以顺序的方式（即，一种成分在另一种成分施用后适度短的时期之后施用，如几小时或几天），组合使用这些单一活性成分来施用。施用选自表1至表12和表P的具有式I的化合物和如上所述的活性成分的顺序对于实施本发明不是本质性的。

[0545] 根据本发明的组合物还可以包含另外的固体助剂或液体助剂，如稳定剂，例如未环氧化的或环氧化的植物油（例如环氧化的椰子油、菜籽油或大豆油），消泡剂（例如硅酮油），防腐剂，粘度调节剂，粘合剂和/或增粘剂，肥料或其他用于获得特定效果的活性成分，例如杀细菌剂、杀真菌剂、杀线虫剂、植物活化剂、杀软体动物剂或除草剂。

[0546] 根据本发明的组合物是以本身已知的方式，在不存在助剂的情况下，例如通过研磨、筛选和/或压缩固体活性成分；和在至少一种助剂的存在下，例如通过紧密混合活性成分与一种或多种助剂和/或将活性成分与一种或多种助剂一起研磨来制备。用于制备组合物的这些方法和用于制备这些组合物的化合物I的用途也是本发明的主题。

[0547] 这些组合物的施用方法，即控制上述类型的有害生物的方法，如喷雾、雾化、撒粉、刷涂、包衣、撒播或浇灌 - 它们被选择以适于普遍情况的预期目的 - 以及这些组合物用于控制上述类型的有害生物用途是本发明的其他主题。典型的浓度比是在0.1与1000ppm之间，优选在0.1与500ppm之间的活性成分。每公顷的施用率总体上是每公顷1g到2000g活性成分，尤其是10g/ha到1000g/ha，优选地是10g/ha到600g/ha。

[0548] 在作物保护领域中，优选的施用方法是施用至这些植物的叶（叶施药），可能的是选择施用的频率和量以符合所讨论的有害生物的侵染风险。可替代地，该活性成分可以通过根系统（内吸作用）到达植物，这是通过用液体组合物将这些植物的所在地浸透或者通过将固体形式的活性成分引入植物的所在地（例如引入土壤，例如以颗粒（土施）的形式）来实现的。在水稻作物的情况下，这样的颗粒剂可以被计量地加入淹水的稻田中。

[0549] 本发明的这些化合物及其组合物还适合于植物繁殖材料的保护（例如种子，像果实、块茎或籽粒，或者苗圃植物），以对抗上述类型的有害生物。可以用所述化合物在种植前

对所述繁殖材料进行处理,例如可以在播种前对种子进行处理。可替代地,所述化合物可以施用至种子籽粒(包衣),这是通过将籽粒浸渍入液体组合物中或通过包衣固体组合物层实现的。还可能在所述繁殖材料被种植在施用处时施用所述组合物,例如在条播期间将所述组合物施入种子犁沟。这些用于植物繁殖材料的处理方法和因此处理的植物繁殖材料是本发明另外的主题。典型的处理比率将取决于有待控制的植物以及有害生物/真菌,并且通常在每100kg种子1克至200克之间、优选在每100kg种子5克至150克之间,如在每100kg种子10克至100克之间。

[0550] 术语种子包括所有种类的种子以及植物繁殖体,包括但并不限于真正的种子、种子块、吸盘、谷粒、鳞球茎、果实、块茎、谷物、根茎、插条、切割枝条等等并且在优选实施例中意指真正的种子。

[0551] 本发明还包括用具有式I的化合物包衣或处理的种子或含有具有式I的化合物的种子。尽管成分的较多或较少的部分可以渗透到该种子材料中,这取决于施用的方法,术语“包衣或处理和/或含有”通常表示在施用的时候,在大多数情况下,该活性成分在该种子的表面。当所述种子产品被(再)种植时,它可以吸收活性成分。在实施例中,本发明使得其上粘附有具有式(I)的化合物的植物繁殖材料可得。此外,由此可得包含用具有式(I)的化合物处理过的植物繁殖材料的组合物。

[0552] 种子处理包括本领域中已知的所有合适的种子处理技术,如拌种、种子包衣、种子撒粉、浸种以及种子造粒。可以通过任何已知的方法实现具有式(I)的化合物的种子处理施用,如在种子播种之前或播种/种植期间喷雾或通过撒粉。

[0553] 生物学实例:

[0554] 接下来的实例用来阐明本发明。本发明的某些化合物与已知的化合物的区别可以在于在低施用率下更大的效力,这可以由本领域的技术人员使用在实例中概述的实验程序,使用更低的施用率(如果必要的话)例如,50ppm、25ppm、12.5ppm、6ppm、3ppm、1.5ppm、0.8ppm、0.2ppm或0.05ppm来证实。

[0555] 实例B1:对抗小菜蛾(Plutella xylostella)(小菜蛾(Diamond back moth))的活性

[0556] 将具有人工饲料的24孔微量滴定板用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液通过移液进行处理。在干燥之后,用L2期幼虫对板进行侵染(10至15只/孔)。侵染之后5天,相比于未处理样品,针对死亡率和生长抑制对这些样品进行评估。

[0557] 以下化合物在200ppm施用率下给出了两个类别(死亡率或生长抑制)中至少一个的至少80%的效果:P1、P3、P4、P6、P7、P8、P9、P10、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P18、P19、P21、P22、P23、P24。

[0558] 实例B2:对抗桃蚜(绿色桃蚜虫)的活性

[0559] 将向日葵叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并且用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后,将这些叶圆片用混合年龄的蚜虫群体进行侵染。侵染之后6天,针对死亡率对这些样品进行评估。

[0560] 以下化合物在200ppm施用率下产生至少80%的死亡率:P1、P2、P3、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P18、P19、P22、P23。

[0561] 实例B3:对抗桃蚜(绿色桃蚜虫)的活性

[0562] 将受到混合年龄的蚜虫种群侵染的豌豆幼苗的根部直接置于从10'000DMSO储备溶液制备的水性测试溶液中。将幼苗放置在测试溶液中6天之后,针对死亡率对这些样品进行评估。

[0563] 以下化合物在24ppm测试比率下得到至少80%的死亡率:P1、P2、P3、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P18、P19、P22、P23。

[0564] 实例B4:对抗西花蓟马(Frankliniella occidentalis) (西方花蓟马(Western flower thrips))的活性

[0565] 将向日葵叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并且用从10'000DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后,将叶圆片用混合年龄的花蓟马种群进行侵染。侵染之后7天,针对死亡率对这些样品进行评估。

[0566] 以下化合物在200ppm施用率下产生至少80%的死亡率:P1、P4、P7、P8、P9、P10、P14、P15、P19、P22。

[0567] 实例B5:对抗烟粉虱(棉粉虱)的活性

[0568] 将棉花叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并且用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后,将叶圆片用成年粉虱进行侵染。孵育之后6天,针对死亡率对这些样品进行检查。

[0569] 以下化合物在200ppm施用率下产生至少80%的死亡率:P1、P3、P4、P5、P6、P8、P9、P10、P12、P14、P15、P16、P18、P19、P22、P23。

[0570] 实例B6:对抗英雄美洲蝽(Euschistus heros) (新热带褐臭蝽)的活性

[0571] 将24孔微量滴定板中的琼脂上的大豆叶片用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后,用N-2期若虫对叶片进行侵染。侵染之后5天,相比于未处理样品,针对死亡率和生长抑制对这些样品进行评估。

[0572] 以下化合物在200ppm施用率下给出了两个类别(死亡率或生长抑制)中至少一个的至少80%的效果:P1、P2、P3、P4、P5、P6、P8、P9、P10、P13、P14、P15、P16、P17、P18、P19、P21、P22、P23。

[0573] 实例B7:对抗黄瓜条叶甲(玉米根虫)的活性

[0574] 将24孔微量滴定板中的置于琼脂层上的玉米芽通过喷雾用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行处理。在干燥之后,用L2期幼虫对板进行侵染(6至10只/孔)。侵染之后4天,相比于未处理样品,针对死亡率和生长抑制对这些样品进行评估。

[0575] 以下化合物在200ppm施用率下给出了两个类别(死亡率或生长抑制)中至少一个的至少80%的效果:P1、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P13、P14、P15、P16、P18、P22、P23、P24。

[0576] 实例B8:对抗海灰翅夜蛾(埃及棉叶虫)的活性

[0577] 将棉花叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并且用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后,将叶圆片用五只L1期幼虫进行侵染。侵染之后3天,相比于未处理样品,针对死亡率、拒食效果以及生长抑制对这些样品进行评估。当这些类别(死亡率、拒食效果和生长抑制)中的至少一个高于未处理的样品时,实现测试样品对海灰翅夜蛾的控制。

[0578] 以下化合物在200ppm施用率下产生至少80%的控制:P4、P8、P13、P14、P15、P16、P21、P24。

[0579] 实例B9:对抗烟蓟马(Thrips tabaci) (葱蓟马)的活性

[0580] 将向日葵叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并且用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后,将叶圆片用混合年龄的蓟马种群进行侵染。侵染之后6天,针对死亡率对这些样品进行评估。

[0581] 以下化合物在200ppm的施用率下导致至少80%的死亡率:P1。