



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 116783193 A

(43) 申请公布日 2023. 09. 19

(21) 申请号 202280010967.0

D·埃默里 B·库尔特兹

(22) 申请日 2022.01.21

(74) 专利代理机构 中国贸促会专利商标事务所
有限公司 11038

(30) 优先权数据

202111002976 2021.01.21 IN

专利代理师 张敏

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2023.07.20

(51) Int.Cl.

C07D 471/04 (2006.01)

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/EP2022/051396 2022.01.21

(87) PCT国际申请的公布数据

W02022/157334 EN 2022.07.28

(71) 申请人 先正达农作物保护股份公司

地址 瑞士巴塞尔

(72) 发明人 V·斯凯瓦 S·伦德勒

M·米尔巴赫 S·萨斯梅尔

A·斯托勒 A·珍格纳特

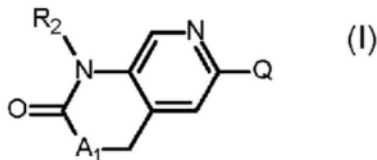
权利要求书9页 说明书144页

(54) 发明名称

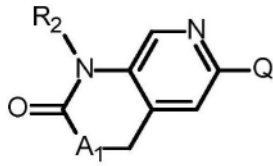
具有含硫取代基的杀有害生物活性的杂环
衍生物

(57) 摘要

披露了具有式(I)的化合物,其中取代基如
权利要求1中所定义。此外,本发明涉及包含具有
式(I)的化合物的农用化学组合物,这些组合物的
制备,以及这些化合物或组合物在农业或园艺
中用于对抗、预防或控制动物有害生物用途,
这些动物有害生物包括节肢动物并且特别是昆
虫、线虫、软体动物或蜱螨目的代表。



1. 一种具有式(I)的化合物:



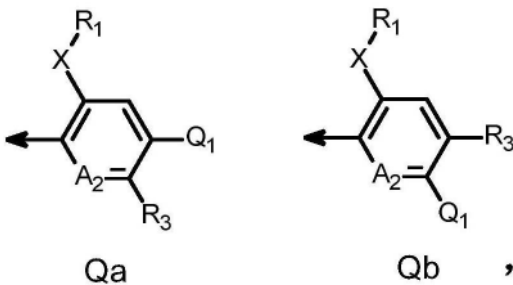
(I),

其中

R₂是C₁-C₆卤代烷基;

A₁是CH₂或O;

Q是选自由以下组成的组的基团:式Qa和Qb



其中箭头指示与双环的碳原子的附接点;

并且其中A₂表示CH或N;

X是S、SO或SO₂;

R₁是C₁-C₄烷基或C₃-C₆环烷基-C₁-C₄烷基;

Q₁是氢、卤素、C₁-C₆卤代烷基、C₃-C₆环烷基、被氰基单取代的C₃-C₆环烷基、C₁-C₆氰基烷基、C₁-C₆氰基烷氧基、C₁-C₆卤代烷氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、-N(R₄)CON(R₄)₂、(噁唑烷-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基;或者

Q₁是经由环碳原子连接至含有取代基A₂的环的五元至六元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或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、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄卤代烷氧基、C₁-C₄烷基硫烷基、C₁-C₄烷基亚磺酰基和C₁-C₄烷基磺酰基;并且所述环体系可以含有选自由以下组成的组的1、2或3个环杂原子:氮、氧和硫,其中所述环体系可以含有不多于一个环氧原子和不多于一个环硫原子;或者

Q₁是经由环氮原子连接至含有取代基A₂的环的五元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或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、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄卤代烷氧基、C₁-C₄烷基硫烷基、C₁-C₄烷基亚磺酰基和C₁-C₄烷基磺酰基;并且所述环体系含有选自由以下组成的组的1、2或3个环杂原子:氮、氧和硫,其中所述环体系含有至少一个环氮原子并且可以含有不多于一个环氧原子和不多于一个环硫原子;

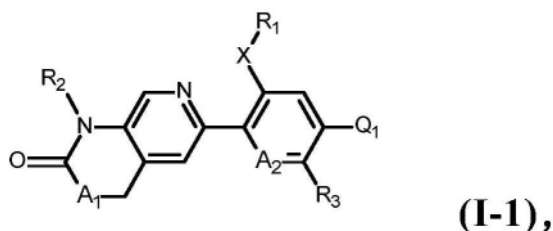
R₃是氢、卤素或C₁-C₄烷基;

每个R₄独立地是氢、C₁-C₄烷基或C₃-C₆环烷基;并且

R₅是C₁-C₆烷基、C₁-C₆卤代烷基或C₃-C₆环烷基;

或具有式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、互变异构体或N-氧化物。

2. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物,所述化合物由以下表示:具有式(I-1)的化合物:



其中 A_1 、 A_2 、 X 、 R_1 、和 R_2 是如权利要求1中在式I下定义的,或具有式I-1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、互变异构体或N-氧化物,并且其中

Q_1 是氢、卤素、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、被氰基单取代的 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_6 氰基烷基、 C_1 - C_6 氰基烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基;或者

Q_1 是经由环碳原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元至六元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基;并且所述环体系可以含有1或2个环氮原子;或者

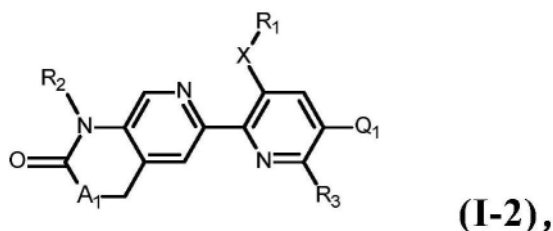
Q_1 是经由环氮原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基;并且所述环体系含有2或3个环氮原子;

R_3 是氢或 C_1 - C_4 烷基;

每个 R_4 独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基;并且

R_5 优选地是 C_1 - C_6 烷基或 C_3 - C_6 环烷基。

3. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物,所述化合物由以下表示:具有式(I-2)的化合物:



其中 A_1 、 X 、 R_1 、和 R_2 是如权利要求1中在式I下定义的,或具有式I-2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、互变异构体或N-氧化物,并且其中

Q_1 是氢、卤素、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、被氰基单取代的 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_6 氰基烷基、 C_1 - C_6 氰基烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基;或者

Q_1 是经由环碳原子连接至被 $X-R_1$ 取代的吡啶环的五元至六元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基;并且所述环体系可以含有1或2个环氮原子;或者

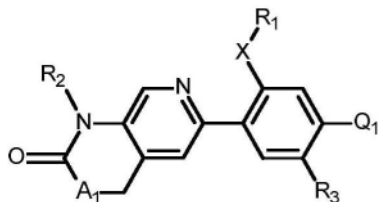
Q_1 是经由环氮原子连接至被 $X-R_1$ 取代的吡啶环的五元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基;并且所述环体系含有2或3个环氮原子;

R_3 是氢或 C_1 - C_4 烷基；

每个 R_4 独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基；并且

R_5 是 C_1 - C_6 烷基或 C_3 - C_6 环烷基。

4. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物,所述化合物由以下表示:具有式(I-3)的化合物:



(I-3),

其中 A_1 、 X 、 R_1 和 R_2 是如权利要求1中在式I下定义的,或具有式I-3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、互变异构体或N-氧化物,并且其中

Q_1 是氢、卤素、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、被氰基单取代的 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_6 氰基烷基、 C_1 - C_6 氰基烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基;或者

Q_1 是经由环碳原子连接至被 $X-R_1$ 取代的苯环的五元至六元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基;并且所述环体系可以含有1或2个环氮原子;或者

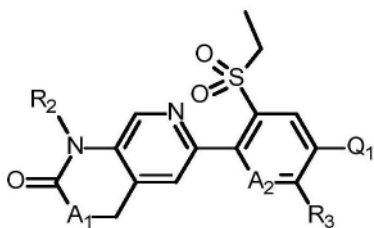
Q_1 是经由环氮原子连接至被 $X-R_1$ 取代的苯环的五元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基;并且所述环体系含有2或3个环氮原子;

R_3 是氢或 C_1 - C_4 烷基;

每个 R_4 独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基;并且

R_5 是 C_1 - C_6 烷基或 C_3 - C_6 环烷基。

5. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物,所述化合物由以下表示:具有式(I-4)的化合物:



(I-4),

其中

A_1 是 CH_2 或 O ;

A_2 是 CH 或 N ,或者 A_2 是 N ;

R_2 是 C_1 - C_6 卤代烷基,或者 R_2 是 C_1 - C_6 氟烷基,或者 R_2 是 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHFCF_3$;

R_3 是氢或 C_1 - C_4 烷基,或者 R_3 是氢或甲基;

Q_1 是氢、卤素、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、被氰基单取代的 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_6 氰基烷

基、 C_1-C_6 氰基烷氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或者

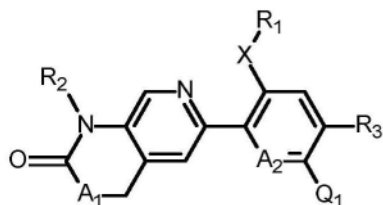
Q_1 是经由环碳原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元至六元芳香族环体系，所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代：卤素、氰基和 C_1-C_4 卤代烷基；并且所述环体系可以含有1或2个环氮原子；或者

Q_1 是经由环氮原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元芳香族环体系，所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代：卤素、氰基和 C_1-C_4 卤代烷基；并且所述环体系含有2或3个环氮原子；

每个 R_4 独立地是氢或 C_1-C_4 烷基，或者每个 R_4 是氢或甲基；并且

R_5 是 C_1-C_6 烷基或 C_3-C_6 环烷基，或者 R_5 是甲基、乙基或环丙基，或者 R_5 是甲基或环丙基；或具有式I-4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、互变异构体或N-氧化物。

6. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物，所述化合物由以下表示：具有式(I-5)的化合物：



(I-5),

其中 A_1 、 A_2 、 X 、 R_1 和 R_2 是如权利要求1中在式I下定义的，或具有式I-5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、互变异构体或N-氧化物，并且其中

Q_1 是氢、卤素、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、被氰基单取代的 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_6 氰基烷基、 C_1-C_6 氰基烷氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基；或者

Q_1 是经由环碳原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元至六元芳香族环体系，所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代：卤素、氰基和 C_1-C_4 卤代烷基；并且所述环体系可以含有1或2个环氮原子；或者

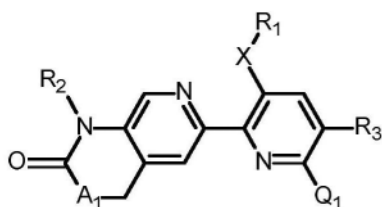
Q_1 是经由环氮原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元芳香族环体系，所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代：卤素、氰基和 C_1-C_4 卤代烷基；并且所述环体系含有2或3个环氮原子；

R_3 是氢或 C_1-C_4 烷基；

每个 R_4 独立地是氢或 C_1-C_4 烷基；并且

R_5 是 C_1-C_6 烷基或 C_3-C_6 环烷基。

7. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物，所述化合物由以下表示：具有式(I-6)的化合物：



(I-6),

其中 A_1 、 X 、 R_1 、和 R_2 是如权利要求1中在式I下定义的,或具有式I-6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、互变异构体或N-氧化物,并且其中

Q_1 是氢、卤素、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、被氰基单取代的 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_6 氰基烷基、 C_1 - C_6 氰基烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基;或者

Q_1 是经由环碳原子连接至被 $X-R_1$ 取代的吡啶环的五元至六元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基;并且所述环体系可以含有1或2个环氮原子;或者

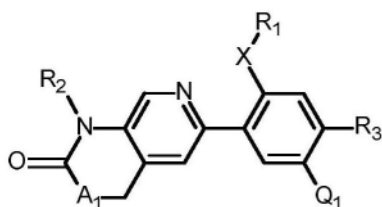
Q_1 是经由环氮连接至被 $X-R_1$ 取代的吡啶环的五元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基;并且所述环体系含有2或3个环氮原子;

R_3 是氢或 C_1 - C_4 烷基;

每个 R_4 独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基;并且

R_5 是 C_1 - C_6 烷基或 C_3 - C_6 环烷基。

8. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物,所述化合物由以下表示:具有式(I-7)的化合物:



(I-7),

其中 A_1 、 X 、 R_1 、和 R_2 是如权利要求1中在式I下定义的,或具有式I-7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、互变异构体或N-氧化物,并且其中

Q_1 是氢、卤素、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、被氰基单取代的 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_6 氰基烷基、 C_1 - C_6 氰基烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基;或者

Q_1 是经由碳原子连接至被 $X-R_1$ 取代的苯环的五元至六元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基;并且所述环体系可以含有1或2个环氮原子;或者

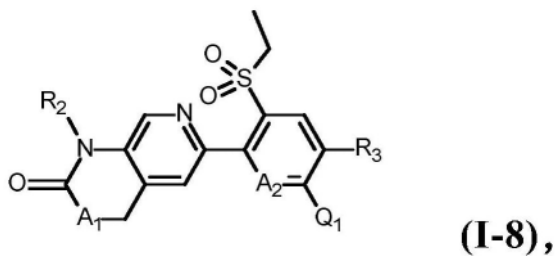
Q_1 是经由氮原子连接至被 $X-R_1$ 取代的苯环的五元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基;并且所述环体系含有2或3个环氮原子;

R_3 是氢或 C_1 - C_4 烷基;

每个 R_4 独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基;并且

R_5 是 C_1 - C_6 烷基或 C_3 - C_6 环烷基。

9. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物,所述化合物由以下表示:具有式(I-8)的化合物:



其中

A_1 是 CH_2 或 O ;

A_2 是 CH 或 N ,或者 A_2 是 N ;

R_2 是 C_1 - C_6 卤代烷基,或者 R_2 是 C_1 - C_6 氟烷基,或者 R_2 是 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHF_2CF_3$;

R_3 是氢或 C_1 - C_4 烷基,或者 R_3 是氢或甲基;

Q_1 是氢、卤素、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、被氰基单取代的 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_6 氰基烷基、 C_1 - C_6 氰基烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基;或者

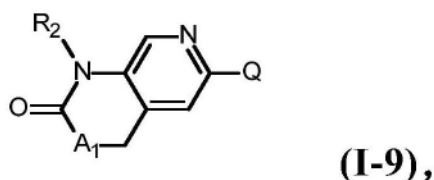
Q_1 是经由环碳原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元至六元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基;并且所述环体系可以含有1或2个环氮原子;或者

Q_1 是经由环氮原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基;并且所述环体系含有2或3个环氮原子;

每个 R_4 独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基,或者每个 R_4 是氢或甲基;并且

R_5 是 C_1 - C_6 烷基或 C_3 - C_6 环烷基;或者 R_5 是甲基、乙基或环丙基,或者 R_5 是甲基或环丙基;或具有式I-8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、互变异构体或N-氧化物。

10. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物,所述化合物由以下表示:具有式(I-9)的化合物:

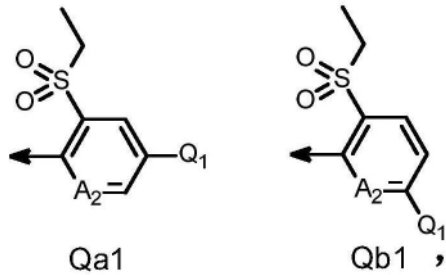


其中

A_1 是 CH_2 或 O ;

R_2 是 C_1 - C_6 卤代烷基,或者 R_2 是 C_1 - C_6 氟烷基,或者 R_2 是 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHF_2CF_3$;

Q 是选自由以下组成的组的基团:式Qa1和Qb1



其中箭头指示与双环的碳原子的附接点；
并且其中

A_2 是CH或N,或者 A_2 是N;并且

Q_1 是氢、卤素、三氟甲基、氟异丙基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$,在其中的每一个中, R_4 独立地是氢或甲基并且 R_5 是甲基、乙基或环丙基;或者 R_5 是甲基或环丙基,或者 Q_1 是(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、N-连接的吡啶基,其是未取代的或被氯、氰基或三氟甲基单取代,或者 Q_1 是N-连接的三唑基或C-连接的嘧啶基;或具有式I-9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、互变异构体或N-氧化物。

11. 根据前述权利要求中任一项所述的化合物,其中 R_2 是 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHFCF_3$ 。

12. 根据前述权利要求中任一项所述的化合物,其中 R_3 是氢或甲基;优选地 R_3 是氢。

13. 根据前述权利要求中任一项所述的化合物,其中 Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHCOCH_3$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)COCH_2CH_3$ 、 $-NHC(O)$ (环丙基)、 $-N(CH_3)CO$ (环丙基)、 $-N(H)CONH_2$ 、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(H)CON(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)CONH_2$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CON(CH_3)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

14. 根据前述权利要求中任一项所述的化合物,其中 Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (环丙基)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

15. 根据前述权利要求中任一项所述的化合物,其中 A_1 是 CH_2 并且 R_2 是 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$ 。

16. 根据权利要求1-14中任一项所述的化合物, A_1 是O并且 R_2 是 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$ 。

17. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物,其选自由以下组成的组:

6-(3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(化合物P1);1-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈(化合物P2);1-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈(化合物P3);1-[5-乙基

硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈(化合物P4);6-[5-(3-氯吡啶-1-基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(化合物P5);1-[5-乙基硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈(化合物P6);N-[5-乙基硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙酰胺(化合物P7);和N-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙酰胺(化合物P8);6-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(化合物P9);6-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(化合物P10);2-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]-2-甲基-丙腈(化合物P11);1-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈(化合物P12);6-[3-乙基磺酰基-6-(1,2,4-三唑-1-基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(化合物P13);6-(6-环丙基-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(化合物P14);2-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]-2-甲基-丙腈(化合物P15);6-[3-乙基磺酰基-6-(1,2,4-三唑-1-基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(化合物P16);6-(6-环丙基-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(化合物P17);N-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙酰胺(化合物P18);6-(5-环丙基-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(化合物P19);2-[[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈(化合物P20);6-[3-乙基磺酰基-5-(2-吡啶基氧基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(化合物P21);6-(3-乙基磺酰基-6-噁啶-2-基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(化合物P22);6-[3-乙基磺酰基-5-(1-氟-1-甲基-乙基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(化合物P23);6-[5-(2,2-二氟丙氧基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(化合物P24);6-[5-(2,2-二氟丙氧基)-3-乙基硫烷基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(化合物P25);6-[3-乙基硫烷基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(化合物P26);6-[5-(2,2-二氟丙氧基)-3-乙基硫烷基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(化合物P27);6-[3-乙基硫烷基-5-(甲基氨基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(化合物P28);N-[5-乙基硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙酰胺(化合物P29);6-[3-乙基磺酰基-5-(1-氟-1-甲基-乙基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(化合物P30);6-[5-(2,2-二氟丙氧基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(化合物P31);6-[5-(2,2-二氟丙氧基)-3-乙基亚磺酰基-2-吡啶

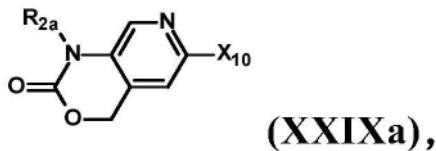
基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(化合物P32);2-[5-乙基硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]-2-甲基-丙腈(化合物P33);1-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈(化合物P34);1-[5-乙基硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈(化合物P35)。

18. 一种组合物,所述组合物包含杀昆虫、杀螨、杀线虫或杀软体动物有效量的如权利要求1-17中任一项所定义的具有式(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,以及任选地,助剂或稀释剂。

19. 一种对抗并控制昆虫、螨、线虫或软体动物的方法,所述方法包括向有害生物、有害生物的场所、或易受有害生物攻击的植物施用杀昆虫、杀螨、杀线虫或杀软体动物有效量的如权利要求1-17中任一项所定义的具有式(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,或如权利要求18所定义的组合物。

20. 一种用于保护植物繁殖材料免受昆虫、螨、线虫或软体动物攻击的方法,所述方法包括用根据权利要求18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地。

21. 一种具有式XXIXa的化合物



其中

R_{2a}是氢或C₁-C₆卤代烷基;并且

X₁₀是卤素或拟卤素离去基团。

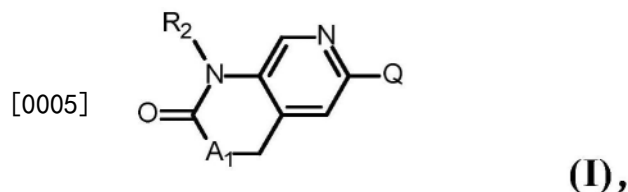
具有含硫取代基的杀有害生物活性的杂环衍生物

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

[0002] 具有杀有害生物作用的杂环化合物是已知的并且描述于例如WO 2013191112、WO 2021136722和WO 2021224409中。

[0003] 现在已经出人意料地发现,某些具有含硫取代基的新颖杀有害生物活性衍生物作为杀有害生物剂具有有利的特性。

[0004] 因此本发明提供了具有式I的化合物,

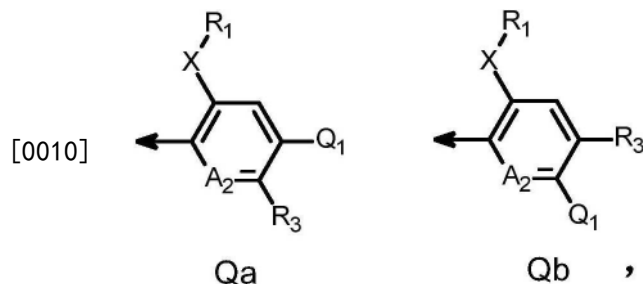


[0006] 其中

[0007] R₂是C₁-C₆卤代烷基;

[0008] A₁是CH₂或O;

[0009] Q是选自由以下组成的组的基团:式Qa和Qb



[0011] 其中箭头指示与双环的碳原子的附接点;

[0012] 并且其中A₂表示CH或N;

[0013] X是S、SO或SO₂;

[0014] R₁是C₁-C₄烷基或C₃-C₆环烷基-C₁-C₄烷基;

[0015] Q₁是氢、卤素、C₁-C₆卤代烷基、C₃-C₆环烷基、被氰基单取代的C₃-C₆环烷基、C₁-C₆氰基烷基、C₁-C₆氰基烷氧基、C₁-C₆卤代烷氧基、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、-N(R₄)CON(R₄)₂、(噁唑烷-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基;或者

[0016] Q₁是经由环碳原子连接至含有取代基A₂的环的五元至六元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或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、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄卤代烷氧基、C₁-C₄烷基硫烷基、C₁-C₄烷基亚磺酰基和C₁-C₄烷基磺酰基;并且所述环体系可以含有选自由以下组成的组的1、2或3个环杂原子:氮、氧和硫,其中所述环体系可以含有不多于一个环氧原子和不多于一个环硫原子;或者

[0017] Q₁是经由环氮原子连接至含有取代基A₂的环的五元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或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、C₁-C₄烷基、C₁-C₄

卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷基硫烷基、 C_1-C_4 烷基亚磺酰基和 C_1-C_4 烷基磺酰基；并且所述环体系含有选自以下组成的组的1、2或3个环杂原子：氮、氧和硫，其中所述环体系含有至少一个环氮原子并且可以含有不多于一个环氧原子和不多于一个环硫原子；

[0018] R_3 是氢、卤素或 C_1-C_4 烷基；

[0019] 每个 R_4 独立地是氢、 C_1-C_4 烷基或 C_3-C_6 环烷基；并且

[0020] R_5 是 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基或 C_3-C_6 环烷基。

[0021] 本发明还提供了具有式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。

[0022] 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（如矿物酸，例如高氯酸、硫酸、硝酸、亚硝酸、磷酸或氢卤酸），强有机羧酸（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，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，如羟基羧酸，例如抗坏血酸、乳酸、苹果酸、酒石酸或柠檬酸，或如苯甲酸），或有机磺酸（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，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（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。

[0023] 在每种情况下，根据本发明的具有式I的化合物是处于游离形式、被氧化的形式如N-氧化物、或盐的形式（例如农艺学上可用的盐的形式）。

[0024] N-氧化物是叔胺的氧化形式或含氮杂芳香族化合物的氧化形式。例如，A. Albini和S. Pietra于1991年在博卡拉顿(Boca Raton) CRC出版社出版的名为“Heterocyclic N-oxides[杂环N-氧化物]”一书中描述了它们。

[0025] 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。

[0026] 在取代基被指示为本身被进一步取代时，这意指它们带有一个或多个相同的或不同的取代基，例如一至四个取代基。通常地，同时存在不超过三个这样的任选的取代基。优选地，同时存在不多于两个这样的取代基（即，该基团被所指示取代基中的一个或两个取代）。在额外的取代基是较大的基团如环烷基或苯基时，最优选的是仅存在一个这样的任选的取代基。在基团被指示为被例如烷基取代时，这包括是其他基团的一部分的那些基团，例如烷硫基中的烷基。

[0027] 如本文所用，术语“ C_1-C_n 烷基”是指具有1至n个碳原子、经由任一碳原子附接的饱和直链或支链烃基，例如以下基团中的任一种：甲基、乙基、正丙基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、正己基、正戊基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基、或1-乙基-2-甲基丙基。

[0028] 如本文所用，术语“ C_1-C_n 卤代烷基”是指具有1至n个碳原子、经由任一碳原子附接的直链或支链饱和烷基基团（如上所提及的），其中这些基团中的一些或全部氢原子可以被

氟、氯、溴和/或碘替代,即,例如以下中的任一种:氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、2-氟乙基、2-氯乙基、2-溴乙基、2-碘乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基、2-氟丙基、3-氟丙基、2,2-二氟丙基、2,3-二氟丙基、2-氯丙基、3-氯丙基、2,3-二氯丙基、2-溴丙基、3-溴丙基、3,3,3-三氟丙基、3,3,3-三氯丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、七氟丙基、1-(氟甲基)-2-氟乙基、1-(氯甲基)-2-氯乙基、1-(溴甲基)-2-溴乙基、4-氟丁基、4-氯丁基、4-溴丁基或九氟丁基。相应地,术语“ C_1-C_2 -氟烷基”将是指携带1、2、3、4、或5个氟原子的 C_1-C_2 -烷基基团,例如以下中的任一种:二氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,1,2,2-四氟乙基或五氟乙基。

[0029] 如本文所用,术语“ C_1-C_n 烷氧基”是指经由氧原子附接的具有1至n个碳原子的直链或支链饱和烷基基团(如上所提及的),即,例如以下中的任一种:甲氧基、乙氧基、正丙氧基、1-甲基乙氧基、正丁氧基、1-甲基丙氧基、2-甲基丙氧基或1,1-二甲基乙氧基。

[0030] 如本文所用,术语“ C_1-C_n 卤代烷氧基”是指如上所提及的 C_1-C_n 烷氧基基团,其部分或全部被氟、氯、溴和/或碘取代,即,例如以下中的任一种:氯甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2-溴乙氧基、2-碘乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、五氟乙氧基、2-氟丙氧基、3-氟丙氧基、2,2-二氟丙氧基、2,3-二氟丙氧基、2-氯丙氧基、3-氯丙氧基、2,3-二氯丙氧基、2-溴丙氧基、3-溴丙氧基、3,3,3-三氟丙氧基、3,3,3-三氯丙氧基、2,2,3,3,3-五氟丙氧基、七氟丙氧基、1-(氟甲基)-2-氟乙氧基、1-(氯甲基)-2-氯乙氧基、1-(溴甲基)-2-溴乙氧基、4-氟丁氧基、4-氯丁氧基、或4-溴丁氧基。

[0031] 如本文所用,术语“ C_1-C_n 烷基硫烷基”是指经由硫原子附接的具有1至n个碳原子的直链或支链饱和烷基基团(如上所提及的),即,例如以下中的任一种:甲硫基、乙硫基、正丙硫基、1-甲基乙硫基、丁硫基、1-甲基丙硫基、2-甲基丙硫基或1,1-二甲基乙硫基。

[0032] 如本文所用,术语“ C_1-C_n 烷基亚磺酰基”是指经由亚磺酰基的硫原子附接的具有1至n个碳原子的直链或支链饱和烷基基团(如上所提及的),即,例如以下中的任一种:甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正丙基亚磺酰基、1-甲基乙基-亚磺酰基、正丁基亚磺酰基、1-甲基丙基亚磺酰基、2-甲基丙基亚磺酰基、1,1-二甲基-乙基亚磺酰基、正戊基亚磺酰基、1-甲基丁基亚磺酰基、2-甲基丁基亚磺酰基、3-甲基-丁基亚磺酰基、1,1-二甲基丙基亚磺酰基、1,2-二甲基丙基亚磺酰基、2,2-二甲基丙基亚磺酰基或1-乙基丙基亚磺酰基。

[0033] 如本文所用,术语“ C_1-C_n 烷基磺酰基”是指经由磺酰基的硫原子附接的具有1至n个碳原子的直链或支链饱和烷基基团(如上所提及的),即,例如以下中的任一种:甲基磺酰基、乙基磺酰基、正丙基磺酰基、异丙基磺酰基、正丁基磺酰基、1-甲基丙基磺酰基、2-甲基丙基磺酰基或叔丁基磺酰基。

[0034] 如本文所用,术语“ C_1-C_n 氰基烷基”是指被氰基取代的具有1至n个碳原子的直链或支链饱和烷基基团(如上所提及的),例如氰基亚甲基、氰基亚乙基、1,1-二甲基氰基甲基、氰基甲基、氰基乙基和1-二甲基氰基甲基。

[0035] 术语“ C_1-C_n 氰基烷氧基”是指经由氧原子附接的以上基团。

[0036] 如本文所用,在术语(如“C₃-C_n环烷基”)后的后缀“-C₁-C_n烷基”(其中n是从1-6的整数)是指被C₃-C_n环烷基取代的直链或支链饱和烷基基团。C₃-C_n环烷基-C₁-C_n烷基的实例是例如,环丙基甲基。

[0037] 如本文所用,术语“C₃-C₆环烷基”是指3-6元环烷基,如环丙烷、环丁烷、环丙烷、环戊烷和环己烷。

[0038] 卤素通常是氟、氯、溴或碘。这也相应地适用于与其他含义组合的卤素,如卤代烷基。

[0039] 在本发明的上下文中,取代基定义中的“单取代或多取代的”典型地意指,取决于取代基的化学结构,单取代的至五次取代的,更优选单取代、双取代或三取代的。

[0040] 在本发明的上下文中,视情况而定,措辞“Q₁是经由环碳原子连接至含有取代基A₂的环的五元至六元芳香族环体系…”和“Q₁是经由环氮原子连接至含有取代基A₂的环的五元芳香族环体系…”是指视情况而定,取代基Q₁的特定实施例与如由式Qa或式Qb表示的基团Q的附接方式。

[0041] 在本发明的上下文中,“Q₁是经由环碳原子连接的五元至六元芳香族环体系…;并且所述环体系可以包含1、2或3个杂原子”的实例是但不限于苯基、吡唑基、三唑基、吡啶基和嘧啶基;优选苯基、2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、嘧啶-2-基、嘧啶-4-基、和嘧啶-5-基。

[0042] 在本发明的上下文中,“Q₁是经由环氮原子连接的五元芳香族环体系…;并且所述环体系含有1、2或3个杂原子”的实例是但不限于吡唑基、吡咯基、咪唑基和三唑基;优选吡咯-1-基、吡唑-1-基、三唑-2-基、1,2,4-三唑-1-基、三唑-1-基、和咪唑-1-基。

[0043] 如下所列,提供了根据本发明的某些实施例。

[0044] 实施例1提供了如上定义的具有式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。

[0045] 实施例2提供了根据实施例1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Q是Qa并且R₂、A₁、A₂、X、R₁、Q₁、R₄、R₅和R₃的优选值如下所列。

[0046] 实施例3提供了根据实施例1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Q是Qb并且R₂、A₁、A₂、X、R₁、Q₁、R₄、R₅和R₃的优选值如下所列。

[0047] 关于实施例1-3,R₂、A₁、A₂、X、R₁、Q₁、R₄、R₅和R₃的优选值是如下列出的(以其任何组合):

[0048] 优选地,R₂是C₁-C₆卤代烷基。

[0049] 更优选地,R₂是C₁-C₆氟烷基。

[0050] 甚至更优选地,R₂是-CH₂CF₂CF₃、-CH₂CF₂CHF₂、-CH₂CF₃、-CH₂CHF₂或-CH₂CF₂CHFCF₃。

[0051] 最优选地,R₂是-CH₂CF₃、-CH₂CF₂CHF₂或-CH₂CF₂CF₃。

[0052] 优选地,A₁是CH₂或O。

[0053] 优选地,A₂是N。

[0054] 优选地,X是S或SO₂。

[0055] 最优选地,X是SO₂。

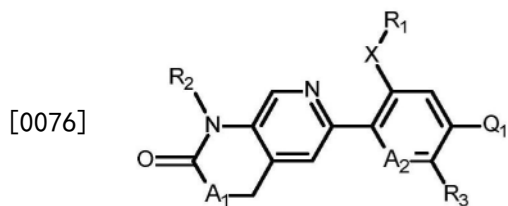
[0056] 优选地,R₁是C₁-C₄烷基或环丙基-C₁-C₄烷基。

- [0057] 更优选地, R_1 是乙基或环丙基甲基。
- [0058] 最优选地, R_1 是乙基。
- [0059] 优选地, Q_1 是氢、卤素、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、被氰基单取代的 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_6 氰基烷基、 C_1 - C_6 氰基烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基或 2-吡啶基氧基; 或者
- [0060] Q_1 是经由环碳原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元至六元芳香族环体系, 所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代: 卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基; 并且所述环体系可以含有 1 或 2 个环氮原子; 或者
- [0061] Q_1 是经由环氮原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元芳香族环体系, 所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代: 卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基; 并且所述环体系含有 2 或 3 个环氮原子。
- [0062] 更优选地, Q_1 是氢、卤素、三氟甲基、氟异丙基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$, 在其中的每一个中, R_4 独立地是氢或甲基并且 R_5 是甲基或环丙基, 或者 Q_1 是 (噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、N-连接的吡啶基 (其是未取代的或被氯、氰基或三氟甲基单取代), 或者 Q_1 是 N-连接的三唑基或 C-连接的嘧啶基。
- [0063] 更优选地, Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHCOC_3H_7$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)COCH_2CH_3$ 、 $-NHCOC_3H_7$ (环丙基)、 $-N(CH_3)CO$ (环丙基)、 $-N(H)CONH_2$ 、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(H)CON(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)CONH_2$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CON(CH_3)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。
- [0064] 最优选地, Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (环丙基)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。
- [0065] 还优选的是当 Q_1 氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (环丙基)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基时。
- [0066] 优选地, 每个 R_4 独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基。
- [0067] 最优选地, 每个 R_4 独立地是氢或甲基。
- [0068] 优选地, R_5 是 C_1 - C_6 烷基或 C_3 - C_6 环烷基。
- [0069] 更优选地, R_5 是甲基、乙基或环丙基。
- [0070] 更优选地, R_5 是甲基或环丙基。
- [0071] 最优选地, R_5 是甲基。
- [0072] 优选地, R_3 是氢或 C_1 - C_4 烷基。

[0073] 更优选地, R_3 是氢或甲基。

[0074] 最优选地, R_3 是氢。

[0075] 根据本发明的一组化合物是具有式 I-1 的那些



[0077] (其中 A_1 、 A_2 、 X 、 R_1 和 R_2 是如对于具有式 I 的化合物(上文)定义的), 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, 并且其中 Q_1 优选地是氢、卤素、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、被氰基单取代的 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_6 氰基烷基、 C_1 - C_6 氰基烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基或 2-吡啶基氧基; 或者

[0078] Q_1 是经由环碳原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元至六元芳香族环体系, 所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代: 卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基; 并且所述环体系可以含有 1 或 2 个环氮原子; 或者

[0079] Q_1 是经由环氮原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元芳香族环体系, 所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代: 卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基; 并且所述环体系含有 2 或 3 个环氮原子;

[0080] R_3 优选地是氢或 C_1 - C_4 烷基;

[0081] 优选地, 每个 R_4 独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基; 并且

[0082] R_5 优选地是 C_1 - C_6 烷基或 C_3 - C_6 环烷基。

[0083] 具有式 I-1 的化合物中的 A_1 、 A_2 、 X 、 R_1 和 R_2 的优选定义是如对于具有式 I 的化合物(上文)定义的, 并且更优选地, Q_1 是氢、卤素、氟异丙基、三氟甲基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$, 在其中的每一个中, R_4 独立地是氢或甲基并且 R_5 是甲基、乙基或环丙基; 优选地甲基或环丙基, 或者 Q_1 是(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、N-连接的吡啶基(其是未取代的或被氯、氰基或三氟甲基单取代), 或者 Q_1 是 N-连接的三唑基或 C-连接的嘧啶基; 并且 R_3 是氢或甲基、优选地氢。

[0084] 在一组具有式 I-1 的化合物中, 优选地, Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (环丙基)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

[0085] 在另一组具有式 I-1 的化合物中, 还优选的是当 Q_1 是氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (环丙基)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基时。

[0086] 根据此实施例的一组化合物是具有式 (I-1a) 的化合物, 其是具有式 (I-1) 的化合物, 其中 A_2 是 N。

[0087] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-1b) 的化合物, 其是具有式 (I-1) 的化合物, 其中 A_2 是 CH。

[0088] 根据此实施例的一组化合物是具有式 (I-1c) 的化合物, 其是具有式 (I-1) 的化合物, 其中 R_2 是 C_1 - C_6 氟烷基; 优选地, R_2 是 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHFCF_3$; 更优选地, R_2 是 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$ 。

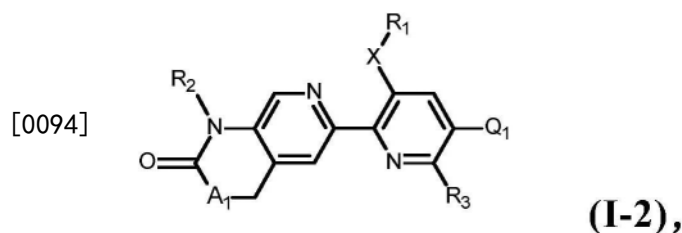
[0089] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-1d) 的化合物, 其是具有式 (I-1) 的化合物, 其中 X 是 S 或 SO_2 ; 优选地, X 是 SO_2 。

[0090] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-1e) 的化合物, 其是具有式 (I-1) 的化合物, 其中 R_1 是 C_1 - C_4 烷基或环丙基- C_1 - C_4 烷基; 优选地, R_1 是乙基或环丙基甲基; 更优选地, R_1 是乙基。

[0091] 根据此实施例的一组化合物是具有式 (I-1f) 的化合物, 其是具有式 (I-1) 的化合物, 其中 A_1 是 CH_2 。

[0092] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-1g) 的化合物, 其是具有式 (I-1) 的化合物, 其中 A_1 是 O。

[0093] 根据本发明的另一组化合物是具有式 I-2 的那些



[0095] (其中 A_1 、X、 R_1 和 R_2 是如对于具有式 I 的化合物 (上文) 定义的), 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, 并且其中 Q_1 优选地是氢、卤素、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、被氰基单取代的 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_6 氰基烷基、 C_1 - C_6 氰基烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基或 2-吡啶基氧基; 或者

[0096] Q_1 是经由环碳原子连接至被 X- R_1 取代的吡啶环的五元至六元芳香族环体系, 所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代: 卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基; 并且所述环体系可以含有 1 或 2 个环氮原子; 或者

[0097] Q_1 是经由环氮原子连接至被 X- R_1 取代的吡啶环的五元芳香族环体系, 所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代: 卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基; 并且所述环体系含有 2 或 3 个环氮原子;

[0098] R_3 优选地是氢或 C_1 - C_4 烷基;

[0099] 优选地, 每个 R_4 独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基; 并且

[0100] R_5 优选地是 C_1 - C_6 烷基或 C_3 - C_6 环烷基。

[0101] 具有式 I-2 的化合物中的 A_1 、X、 R_1 和 R_2 的优选定义是如对于具有式 I 的化合物 (上文) 定义的, 并且更优选地, Q_1 是氢、卤素、三氟甲基、氟异丙基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$, 在

其中的每一个中, R_4 独立地是氢或甲基并且 R_5 是甲基、乙基或环丙基; 优选地甲基或环丙基, 或者 Q_1 是(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、N-连接的吡啶基(其是未取代的或被氯、氰基或三氟甲基单取代), 或者 Q_1 是N-连接的三唑基或C-连接的嘧啶基; 并且 R_3 是氢或甲基、优选地氢。

[0102] 在一组具有式I-2的化合物中, 优选地, Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N(CH₃)CO(环丙基)、-N(H)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CONH(CH₃)、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

[0103] 在另一组具有式I-2的化合物中, 还优选的是当 Q_1 是氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N(CH₃)CO(环丙基)、-N(H)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CONH(CH₃)、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基时。

[0104] 根据此实施例的一组化合物是具有式(I-2a)的化合物, 其是具有式(I-2)的化合物, 其中X是S或SO₂, 优选地X是SO₂。

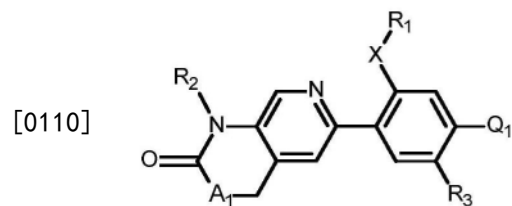
[0105] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-2b)的化合物, 其是具有式(I-2)的化合物, 其中 R_1 是C₁-C₄烷基或环丙基-C₁-C₄烷基, 优选地 R_1 是乙基或环丙基甲基; 更优选地, R_1 是乙基。

[0106] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-2c)的化合物, 其是具有式(I-2)的化合物, 其中 R_2 是C₁-C₆氟烷基; 优选地, R_2 是-CH₂CF₂CF₃、-CH₂CF₂CHF₂、-CH₂CF₃、-CH₂CHF₂或-CH₂CF₂CHFCF₃; 更优选地, R_2 是-CH₂CF₃、-CH₂CF₂CHF₂或-CH₂CF₂CF₃。

[0107] 根据此实施例的一组化合物是具有式(I-2d)的化合物, 其是具有式(I-2)的化合物, 其中 A_1 是CH₂。

[0108] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-2e)的化合物, 其是具有式(I-2)的化合物, 其中 A_1 是O。

[0109] 根据本发明的另一组化合物是具有式I-3的那些



[0111] (其中 A_1 、X、 R_1 和 R_2 是如对于具有式I的化合物(上文)定义的), 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, 并且其中 Q_1 优选地是氢、卤素、C₁-C₆卤代烷基、C₃-C₆环烷基、被氰基单取代的C₃-C₆环烷基、C₁-C₆氰基烷基、C₁-C₆氰基烷氧基、C₁-C₆卤代烷氧基、-N(R_4)₂、-N(R_4)COR₅, 或 -N(R_4)CON(R_4)₂、(噁唑烷-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基; 或者

[0112] Q_1 是经由环碳原子连接至被X- R_1 取代的苯环的五元至六元芳香族环体系, 所述环体系是未取代的或被选自以下组成的组的取代基单取代: 卤素、氰基和C₁-C₄卤代烷基; 并

且所述环体系可以含有1或2个环氮原子;或者

[0113] Q_1 是经由环氮原子连接至被 $X-R_1$ 取代的苯环的五元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1-C_4 卤代烷基;并且所述环体系含有2或3个环氮原子;

[0114] R_3 优选地是氢或 C_1-C_4 烷基;

[0115] 优选地,每个 R_4 独立地是氢或 C_1-C_4 烷基;并且

[0116] R_5 优选地是 C_1-C_6 烷基或 C_3-C_6 环烷基。

[0117] 具有式I-3的化合物中的 A_1 、 X 、 R_1 和 R_2 的优选定义是如对于具有式I的化合物(上文)定义的,并且更优选地, Q_1 是氢、卤素、三氟甲基、氟异丙基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$,在其中的每一个中, R_4 独立地是氢或甲基并且 R_5 是甲基、乙基或环丙基;优选地甲基或环丙基,或者 Q_1 是(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、N-连接的吡啶基(其是未取代的或被氯、氰基或三氟甲基单取代),或者 Q_1 是N-连接的三唑基或C-连接的嘧啶基;并且 R_3 是氢或甲基、优选地氢。

[0118] 在一组具有式I-3的化合物中,优选地, Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (环丙基)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

[0119] 在另一组具有式I-3的化合物中,还优选的是当 Q_1 是氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (环丙基)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基时。

[0120] 根据此实施例的一组化合物是具有式(I-3a)的化合物,其是具有式(I-3)的化合物,其中 X 是S或 SO_2 ,优选地 X 是 SO_2 。

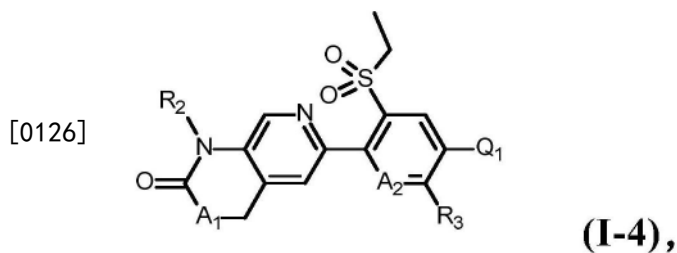
[0121] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-3b)的化合物,其是具有式(I-3)的化合物,其中 R_1 是 C_1-C_4 烷基或环丙基- C_1-C_4 烷基,优选地 R_1 是乙基或环丙基甲基;更优选地, R_1 是乙基。

[0122] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-3c)的化合物,其是具有式(I-3)的化合物,其中 R_2 是 C_1-C_6 氟烷基;优选地, R_2 是 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHFCF_3$;更优选地, R_2 是 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$ 。

[0123] 根据此实施例的一组化合物是具有式(I-3d)的化合物,其是具有式(I-3)的化合物,其中 A_1 是 CH_2 。

[0124] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-3e)的化合物,其是具有式(I-3)的化合物,其中 A_1 是O。

[0125] 根据本发明的另一组化合物是具有式I-4的那些



[0127] 其中

[0128] A_1 是 CH_2 或 O ;

[0129] A_2 是 CH 或 N , 优选地 N ;

[0130] R_2 是 C_1-C_6 卤代烷基, 优选地 R_2 是 C_1-C_6 氟烷基, 更优选地 R_2 是 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHF_2CF_3$;

[0131] R_3 是氢或 C_1-C_4 烷基、优选地氢或甲基;

[0132] Q_1 是氢、卤素、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、被氰基单取代的 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_6 氰基烷基、 C_1-C_6 氰基烷氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基; 或者

[0133] Q_1 是经由环碳原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元至六元芳香族环体系, 所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代: 卤素、氰基和 C_1-C_4 卤代烷基; 并且所述环体系可以含有1或2个环氮原子; 或者

[0134] Q_1 是经由环氮原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元芳香族环体系, 所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代: 卤素、氰基和 C_1-C_4 卤代烷基; 并且所述环体系含有2或3个环氮原子;

[0135] 每个 R_4 独立地是氢或 C_1-C_4 烷基、优选地氢或甲基; 并且

[0136] R_5 是 C_1-C_6 烷基或 C_3-C_6 环烷基, 优选地甲基、乙基或环丙基, 更优选地甲基或环丙基; 或

[0137] 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。

[0138] 根据此实施例的一组化合物是具有式(I-4a)的化合物, 其是具有式(I-4)的化合物, 其中 A_1 是 CH_2 。

[0139] 根据此实施例的另一组优选的化合物是具有式(I-4b)的化合物, 其是具有式(I-4)的化合物, 其中 A_1 是 O 。

[0140] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-4c)的化合物, 其是具有式(I-4)的化合物, 其中 A_2 是 N 。

[0141] 根据此实施例的另一组优选化合物是具有式(I-4d)的化合物, 其是具有式(I-4)的化合物, 其中 A_2 是 CH 。

[0142] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-4e)的化合物, 其是具有式(I-4)的化合物, 其中 R_3 是氢。

[0143] 根据此实施例的另一组优选的化合物是具有式(I-4f)的化合物, 其是具有式(I-4)的化合物, 其中 R_3 是 C_1-C_4 烷基, 优选地甲基。

[0144] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-4g)的化合物, 其是具有式(I-4)的化合物, 其中 A_2 是 N 并且 R_3 是氢。

[0145] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式 (I-4h) 的化合物, 其是具有式 (I-4) 的化合物, 其中 A_1 是 CH_2 , A_2 是 N 并且 R_3 是氢。

[0146] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式 (I-4i) 的化合物, 其是具有式 (I-4) 的化合物, 其中 A_1 是 O, A_2 是 N 并且 R_3 是氢。

[0147] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式 (I-4j) 的化合物, 其是具有式 (I-4) 的化合物, 其中 Q_1 是氢、卤素、三氟甲基、氟异丙基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$, 在其中的每一个中, R_4 独立地是氢或甲基并且 R_5 是甲基、乙基或环丙基, 或者 Q_1 是 (噁唑烷-2-酮)-3-基或 2-吡啶基氧基; 优选地, Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHCOCCH_3$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)COCH_2CH_3$ 、 $-NHCOC(环丙基)$ 、 $-N(CH_3)CO(环丙基)$ 、 $-N(H)CONH_2$ 、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(H)CON(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)CONH_2$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CON(CH_3)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、或 2-吡啶基氧基; 更优选地, Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO(环丙基)$ 、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、或 2-吡啶基氧基。

[0148] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式 (I-4k) 的化合物, 其是具有式 (I-4) 的化合物, 其中 Q_1 是经由环碳原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元至六元芳香族环体系, 所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代: 卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基; 并且所述环体系可以含有 1 或 2 个环氮原子; 优选地, Q_1 是 C-连接的嘧啶基; 更优选地, Q_1 是嘧啶-2-基。

[0149] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式 (I-4l) 的化合物, 其是具有式 (I-4) 的化合物, 其中 Q_1 是经由环氮原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元芳香族环体系, 所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代: 卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基; 并且所述环体系含有 2 个环氮原子; 优选地, Q_1 是 N-连接的吡啶基, 其是未取代的或被氯、氰基或三氟甲基单取代; 更优选地, Q_1 是吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基或 1,2,4-三唑-1-基。

[0150] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式 (I-4m) 的化合物, 其是具有式 (I-4) 的化合物, 其中

[0151] A_1 是 CH_2 或 O;

[0152] A_2 是 N;

[0153] R_2 是 C_1 - C_6 氟烷基、优选地 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$;

[0154] R_3 是氢或 C_1 - C_4 烷基、优选地氢或甲基; 并且

[0155] Q_1 是氢、卤素、三氟甲基、氟异丙基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$, 在其中的每一个中, R_4 独立地是氢或甲基并且 R_5 是甲基、乙基或环丙基, 或者 Q_1 是 (噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、N-连接的吡啶基 (其是未取代的或被氯、氰基或三氟甲基单取代), 或者 Q_1 是 N-连接的三唑基或 C-连接的嘧啶基。

[0156] 根据此实施例的另一组优选的化合物是具有式 (I-4n) 的化合物, 其是具有式 (I-

4)的化合物,其中

[0157] A_1 是 CH_2 或 O ;

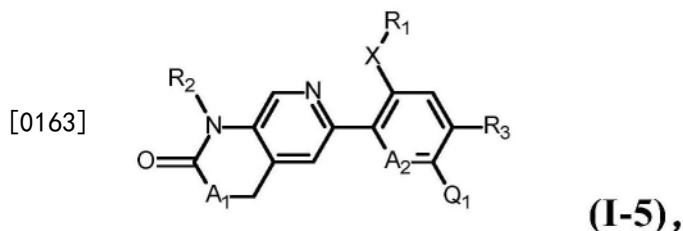
[0158] A_2 是 N ;

[0159] R_2 是 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$;

[0160] R_3 是氢;并且

[0161] Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHCOC_2H_5$ 、 $-N(CH_3)COC_2H_5$ 、 $-N(CH_3)COCH_2CH_3$ 、 $-NHCOC(环丙基)$ 、 $-N(CH_3)CO(环丙基)$ 、 $-N(H)CONH_2$ 、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(H)CON(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)CONH_2$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CON(CH_3)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或咪啉-2-基;优选地, Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COC_2H_5$ 、 $-N(CH_3)CO(环丙基)$ 、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或咪啉-2-基。

[0162] 根据本发明的一组化合物是具有式I-5的那些



[0164] (其中 A_1 、 A_2 、 X 、 R_1 和 R_2 是如对于具有式I的化合物(上文)定义的),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,并且其中 Q_1 优选地是氢、卤素、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、被氰基单取代的 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_6 氰基烷基、 C_1 - C_6 氰基烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基;或者

[0165] Q_1 是经由环碳原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元至六元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基;并且所述环体系可以含有1或2个环氮原子;或者

[0166] Q_1 是经由环氮原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基;并且所述环体系含有2或3个环氮原子;

[0167] R_3 优选地是氢或 C_1 - C_4 烷基;

[0168] 优选地,每个 R_4 独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基;并且

[0169] R_5 优选地是 C_1 - C_6 烷基或 C_3 - C_6 环烷基。

[0170] 具有式I-5的化合物中的 A_1 、 A_2 、 X 、 R_1 和 R_2 的优选定义是如对于具有式I的化合物(上文)定义的,并且更优选地, Q_1 是氢、卤素、三氟甲基、氟异丙基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$,在其中的每一个中, R_4 独立地是氢或甲基并且 R_5 是甲基、乙基或环丙基;优选地甲基

或环丙基,或者 Q_1 是(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、N-连接的吡啶基(其是未取代的或被氯、氰基或三氟甲基单取代),或者 Q_1 是N-连接的三唑基或C-连接的嘧啶基;并且 R_3 是氢或甲基、优选地氢。

[0171] 根据此实施例的一组化合物是具有式(I-5a)的化合物,其是具有式(I-5)的化合物,其中 A_2 是N。

[0172] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-5b)的化合物,其是具有式(I-5)的化合物,其中 A_2 是CH。

[0173] 根据此实施例的一组化合物是具有式(I-5c)的化合物,其是具有式(I-5)的化合物,其中 R_2 是 C_1 - C_6 氟烷基;优选地, R_2 是 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHFCF_3$;更优选地, R_2 是 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$ 。

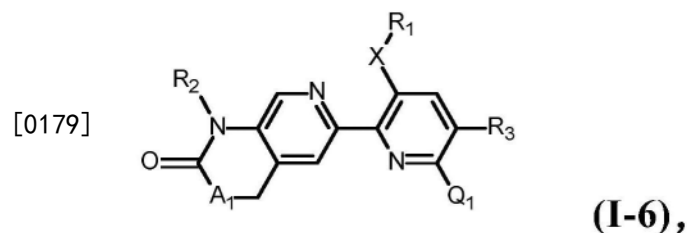
[0174] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-5d)的化合物,其是具有式(I-5)的化合物,其中X是S或 SO_2 ;优选地,X是 SO_2 。

[0175] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-5e)的化合物,其是具有式(I-5)的化合物,其中 R_1 是 C_1 - C_4 烷基或环丙基- C_1 - C_4 烷基;优选地, R_1 是乙基或环丙基甲基;更优选地, R_1 是乙基。

[0176] 根据此实施例的一组化合物是具有式(I-5f)的化合物,其是具有式(I-5)的化合物,其中 A_1 是 CH_2 。

[0177] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-5g)的化合物,其是具有式(I-5)的化合物,其中 A_1 是O。

[0178] 根据本发明的另一组化合物是具有式I-6的那些



[0180] (其中 A_1 、X、 R_1 和 R_2 是如对于具有式I的化合物(上文)定义的),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,并且其中 Q_1 优选地是氢、卤素、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、被氰基单取代的 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_6 氰基烷基、 C_1 - C_6 氰基烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基;或者

[0181] Q_1 是经由环碳原子连接至被X- R_1 取代的吡啶环的五元至六元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基;并且所述环体系可以含有1或2个环氮原子;或者

[0182] Q_1 是经由环氮连接至被X- R_1 取代的吡啶环的五元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基;并且所述环体系含有2或3个环氮原子;

[0183] R_3 优选地是氢或 C_1 - C_4 烷基;

[0184] 优选地,每个 R_4 独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基;并且

[0185] R_5 优选地是 C_1 - C_6 烷基或 C_3 - C_6 环烷基。

[0186] 具有式I-6的化合物中的 A_1 、 X 、 R_1 和 R_2 的优选定义是如对于具有式I的化合物(上文)定义的,并且更优选地, Q_1 是氢、卤素、三氟甲基、氟异丙基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$,在其中的每一个中, R_4 独立地是氢或甲基并且 R_5 是甲基、乙基或环丙基;优选地甲基或环丙基,或者 Q_1 是(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、N-连接的吡啶基(其是未取代的或被氯、氰基或三氟甲基单取代),或者 Q_1 是N-连接的三唑基或C-连接的嘧啶基;并且 R_3 是氢或甲基、优选地氢。

[0187] 在一组具有式I-6的化合物中,优选地 Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (环丙基)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

[0188] 在另一组具有式I-6的化合物中,还优选的是当 Q_1 是氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (环丙基)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基时。

[0189] 根据此实施例的一组化合物是具有式(I-6a)的化合物,其是具有式(I-6)的化合物,其中 X 是 S 或 SO_2 ,优选地 X 是 SO_2 。

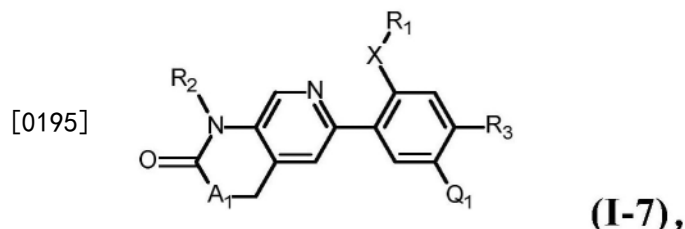
[0190] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-6b)的化合物,其是具有式(I-6)的化合物,其中 R_1 是 C_1 - C_4 烷基或环丙基- C_1 - C_4 烷基,优选地 R_1 是乙基或环丙基甲基;更优选地, R_1 是乙基。

[0191] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-6c)的化合物,其是具有式(I-6)的化合物,其中 R_2 是 C_1 - C_6 氟烷基;优选地, R_2 是 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHFCF_3$;更优选地, R_2 是 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$ 。

[0192] 根据此实施例的一组化合物是具有式(I-6d)的化合物,其是具有式(I-6)的化合物,其中 A_1 是 CH_2 。

[0193] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-6e)的化合物,其是具有式(I-6)的化合物,其中 A_1 是 O 。

[0194] 根据本发明的另一组化合物是具有式I-7的那些



[0196] (其中 A_1 、 X 、 R_1 和 R_2 是如对于具有式I的化合物(上文)定义的),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,并且其中 Q_1 优选地是氢、卤素、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、被氰基单取代的 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_6 氰基烷基、 C_1 - C_6 氰基烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基或2-

吡啶基氧基;或者

[0197] Q_1 是经由碳原子连接至被 $X-R_1$ 取代的苯环的五元至六元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1-C_4 卤代烷基;并且所述环体系可以含有1或2个环氮原子;或者

[0198] Q_1 是经由氮原子连接至被 $X-R_1$ 取代的苯环的五元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1-C_4 卤代烷基;并且所述环体系含有2或3个环氮原子;

[0199] R_3 优选地是氢或 C_1-C_4 烷基;

[0200] 优选地,每个 R_4 独立地是氢或 C_1-C_4 烷基;并且

[0201] R_5 优选地是 C_1-C_6 烷基或 C_3-C_6 环烷基。

[0202] 具有式 I-7 的化合物中的 A_1 、 X 、 R_1 和 R_2 的优选定义是如对于具有式 I 的化合物(上文)定义的,并且更优选地, Q_1 是氢、卤素、三氟甲基、氟异丙基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$, 在其中的每一个中, R_4 独立地是氢或甲基并且 R_5 是甲基、乙基或环丙基;优选地甲基或环丙基,或者 Q_1 是(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、 N -连接的吡啶基(其是未取代的或被氯、氰基或三氟甲基单取代),或者 Q_1 是 N -连接的三唑基或 C -连接的嘧啶基;并且 R_3 是氢或甲基、优选地氢。

[0203] 在一组具有式 I-7 的化合物中,优选地, Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (环丙基)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

[0204] 在另一组具有式 I-7 的化合物中,还优选的是当 Q_1 是氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (环丙基)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基时。

[0205] 根据此实施例的一组化合物是具有式 (I-7a) 的化合物,其是具有式 (I-7) 的化合物,其中 X 是 S 或 SO_2 , 优选地 X 是 SO_2 。

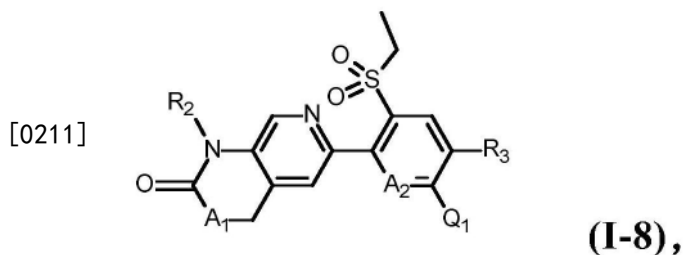
[0206] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-7b) 的化合物,其是具有式 (I-7) 的化合物,其中 R_1 是 C_1-C_4 烷基或环丙基- C_1-C_4 烷基,优选地 R_1 是乙基或环丙基甲基;更优选地, R_1 是乙基。

[0207] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-7c) 的化合物,其是具有式 (I-7) 的化合物,其中 R_2 是 C_1-C_6 氟烷基;优选地, R_2 是 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHF_2$;更优选地, R_2 是 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$ 。

[0208] 根据此实施例的一组化合物是具有式 (I-7d) 的化合物,其是具有式 (I-7) 的化合物,其中 A_1 是 CH_2 。

[0209] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-7e) 的化合物,其是具有式 (I-7) 的化合物,其中 A_1 是 O 。

[0210] 根据本发明的另一组化合物是具有式I-8的那些



[0212] 其中

[0213] A_1 是 CH_2 或O;

[0214] A_2 是CH或N, 优选地N;

[0215] R_2 是 C_1-C_6 卤代烷基, 优选地 R_2 是 C_1-C_6 氟烷基, 更优选地 R_2 是 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHF_2CF_3$;

[0216] R_3 是氢或 C_1-C_4 烷基, 优选地氢或甲基;

[0217] Q_1 是氢、卤素、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、被氰基单取代的 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_6 氰基烷基、 C_1-C_6 氰基烷氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基; 或者

[0218] Q_1 是经由环碳原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元至六元芳香族环体系, 所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代: 卤素、氰基和 C_1-C_4 卤代烷基; 并且所述环体系可以含有1或2个环氮原子; 或者

[0219] Q_1 是经由环氮原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元芳香族环体系, 所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代: 卤素、氰基和 C_1-C_4 卤代烷基; 并且所述环体系含有2或3个环氮原子;

[0220] 每个 R_4 独立地是氢或 C_1-C_4 烷基, 优选地氢或甲基; 并且

[0221] R_5 是 C_1-C_6 烷基或 C_3-C_6 环烷基; 优选地甲基、乙基或环丙基, 更优选地甲基或环丙基; 或

[0222] 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。

[0223] 根据此实施例的一组化合物是具有式(I-8a)的化合物, 其是具有式(I-8)的化合物, 其中 A_1 是 CH_2 。

[0224] 根据此实施例的另一组优选的化合物是具有式(I-8b)的化合物, 其是具有式(I-8)的化合物, 其中 A_1 是O。

[0225] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-8c)的化合物, 其是具有式(I-8)的化合物, 其中 A_2 是N。

[0226] 根据此实施例的另一组优选化合物是具有式(I-8d)的化合物, 其是具有式(I-8)的化合物, 其中 A_2 是CH。

[0227] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-8e)的化合物, 其是具有式(I-8)的化合物, 其中 R_3 是氢。

[0228] 根据此实施例的另一组优选的化合物是具有式(I-8f)的化合物, 其是具有式(I-8)的化合物, 其中 R_3 是 C_1-C_4 烷基, 优选地甲基。

[0229] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-8g)的化合物, 其是具有式

(I-8)的化合物,其中 A_2 是N并且 R_3 是氢。

[0230] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-8h)的化合物,其是具有式(I-8)的化合物,其中 A_1 是 CH_2 , A_2 是N并且 R_3 是氢。

[0231] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-8i)的化合物,其是具有式(I-8)的化合物,其中 A_1 是O, A_2 是N并且 R_3 是氢。

[0232] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-8j)的化合物,其是具有式(I-8)的化合物,其中 Q_1 是氢、卤素、三氟甲基、氟异丙基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$,在其中的每一个中, R_4 独立地是氢或甲基并且 R_5 是甲基、乙基或环丙基,或者 Q_1 是(噁唑烷-2-酮)-3-基或2-吡啶基氧基;优选地, Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHCOC_2H_5$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)COCH_2CH_3$ 、 $-NHCOC(环丙基)$ 、 $-N(CH_3)CO(环丙基)$ 、 $-N(H)CONH_2$ 、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(H)CON(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)CONH_2$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CON(CH_3)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、或2-吡啶基氧基;更优选地, Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO(环丙基)$ 、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、或2-吡啶基氧基。

[0233] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-8k)的化合物,其是具有式(I-8)的化合物,其中 Q_1 是经由环碳原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元至六元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基;并且所述环体系可以含有1或2个环氮原子;优选地, Q_1 是C-连接的嘧啶基;更优选地, Q_1 是嘧啶-2-基。

[0234] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-8l)的化合物,其是具有式(I-8)的化合物,其中 Q_1 是经由环氮原子连接至含有取代基 A_2 的环的五元芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和 C_1 - C_4 卤代烷基;并且所述环体系含有2个环氮原子;优选地, Q_1 是N-连接的吡啶基,其是未取代的或被氯、氰基或三氟甲基单取代;更优选地, Q_1 是吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基或1,2,4-三唑-1-基。

[0235] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-8m)的化合物,其是具有式(I-8)的化合物,其中

[0236] A_1 是 CH_2 或O;

[0237] A_2 是N;

[0238] R_2 是 C_1 - C_6 氟烷基,优选地 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$;

[0239] R_3 是氢或 C_1 - C_4 烷基、优选地氢或甲基;并且

[0240] Q_1 是氢、卤素、三氟甲基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、三氟乙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$,在其中的每一个中, R_4 独立地是氢或甲基并且 R_5 是甲基或环丙基,或者 Q_1 是(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、N-连接的吡啶基(其是未取代的或被氯、氰基或三氟甲基单取代),或者 Q_1 是N-连接的三唑基或C-连接的嘧啶基。

[0241] 根据此实施例的另一组优选的化合物是具有式(I-8n)的化合物,其是具有式(I-

8)的化合物,其中

[0242] A_1 是 CH_2 或 O ;

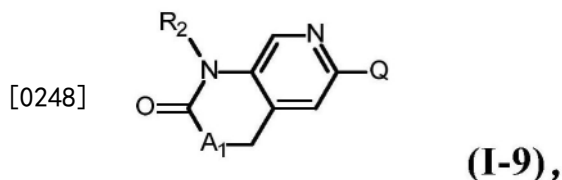
[0243] A_2 是 N ;

[0244] R_2 是 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$;

[0245] R_3 是氢;并且

[0246] Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHCOC(CH_3)_3$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)COCH_2CH_3$ 、 $-NHCOC(环丙基)$ 、 $-N(CH_3)CO(环丙基)$ 、 $-N(H)CONH_2$ 、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(H)CON(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)CONH_2$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CON(CH_3)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或咪啉-2-基;优选地, Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO(环丙基)$ 、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或咪啉-2-基。

[0247] 根据本发明的一组杰出的化合物是具有式I-9的那些

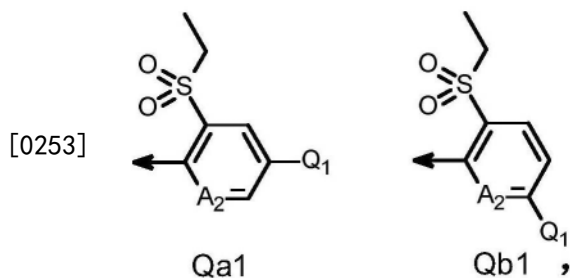


[0249] 其中

[0250] A_1 是 CH_2 或 O ;

[0251] R_2 是 C_1-C_6 卤代烷基,优选地 R_2 是 C_1-C_6 氟烷基,更优选地 R_2 是 $-CH_2CF_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CHF_2CF_3$;

[0252] Q 是选自由以下组成的组的基团:式Qa1和Qb1



[0254] 其中箭头指示与双环的碳原子的附接点;

[0255] 并且其中

[0256] A_2 是 CH 或 N ,优选地 N ;并且

[0257] Q_1 是氢、卤素、三氟甲基、氟异丙基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$,在其中的每一个中, R_4 独立地是氢或甲基并且 R_5 是甲基、乙基或环丙基;优选地 R_5 是甲基或环丙基,或者 Q_1 是(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、N-连接的吡啶基(其是未取代的或被氯、氰基或三氟甲基单取代),或者 Q_1 是N-连接的三唑基或C-连接的咪啉基;

[0258] 优选地, Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHCOCH_3$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)COCH_2CH_3$ 、 $-NHCO$ (环丙基)、 $-N(CH_3)CO$ (环丙基)、 $-N(H)CONH_2$ 、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(H)CON(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)CONH_2$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CON(CH_3)_2$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或咪啉-2-基;

[0259] 更优选地, Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (环丙基)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或咪啉-2-基。

[0260] 根据此实施例的一组化合物是具有式(I-9a)的化合物,其是具有式(I-9)的化合物并且是式(I-9)的优选实施例中的任一个,其中 A_1 是 CH_2 。

[0261] 根据此实施例的另一组优选的化合物是具有式(I-9b)的化合物,其是具有式(I-9)的化合物并且是式(I-9)的优选实施例中的任一个,其中 A_1 是0。

[0262] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-9c)的化合物,其是具有式(I-9)的化合物并且是式(I-9)的优选实施例中的任一个,其中 A_2 是N。

[0263] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-9d)的化合物,其是具有式(I-9)的化合物并且是式(I-9)的优选实施例中的任一个,其中 A_2 是CH。

[0264] 根据此实施例的一组化合物是具有式(I-9e)的化合物,其是具有式(I-9)的化合物并且是式(I-9)的优选实施例中的任一个,其中 R_2 是 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$ 。

[0265] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-9f)的化合物,其是具有式(I-9)的化合物并且是式(I-9)的优选实施例中的任一个,其中 A_1 是 CH_2 , A_2 是N并且 R_2 是 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$ 。

[0266] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-9g)的化合物,其是具有式(I-9)的化合物并且是式(I-9)的优选实施例中的任一个,其中 A_1 是0, A_2 是N并且 R_2 是 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$ 。

[0267] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-9h)的化合物,其是具有式(I-9)的化合物并且是式(I-9)的优选实施例中的任一个,其中 Q_1 是氢、卤素、三氟甲基、氟异丙基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、或 $-N(R_4)CON(R_4)_2$, 在其中的每一个中, R_4 独立地是氢或甲基并且 R_5 是甲基、乙基或环丙基, 或者 Q_1 是(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、N-连接的吡啶基(其是未取代的或被氯、氰基或三氟甲基单取代), 或者 Q_1 是N-连接的三唑基或C-连接的咪啉基; 优选地, Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (环丙基)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或咪啉-2-基。

[0268] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-9i)的化合物,其是具有式(I-9)的化

合物并且是式 (I-9) 的优选实施例中的任一个,其中 Q_1 是氢、1-氰基环丙基、或3-氯-吡啶-1-基。

[0269] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-9j) 的化合物,其是具有式 (I-9) 的化合物并且是式 (I-9) 的优选实施例中的任一个,其中 Q_1 是氯、溴、三氟甲基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、2,2,2-三氟乙氧基、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N(CH₃)CO(环丙基)、-N(H)CONH(CH₃)、或-N(CH₃)CONH(CH₃)。

[0270] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-9k) 的化合物,其是具有式 (I-9) 的化合物并且是式 (I-9) 的优选实施例中的任一个,其中 Q_1 是(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

[0271] 根据此实施例的一组另外杰出的化合物是具有式 (I-9l) 的化合物,其是具有式 (I-9) 的化合物,其中:

[0272] A_1 是CH₂或O;

[0273] R_2 是-CH₂CF₃、-CH₂CF₂CHF₂或-CH₂CF₂CF₃;

[0274] Q是选自由以下组成的组的基团:式Qa1和Qb1,其中

[0275] A_2 是N;并且

[0276] Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、-NH₂、-NH(CH₃)、-N(CH₃)₂、-NHC(O)CH₃、-N(CH₃)COCH₃、-N(CH₃)COCH₂CH₃、-NHC(O)(环丙基)、-N(CH₃)CO(环丙基)、-N(H)CONH₂、-N(H)CONH(CH₃)、-N(H)CON(CH₃)₂、-N(CH₃)CONH₂、-N(CH₃)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CON(CH₃)₂、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

[0277] 根据此实施例的一组另外杰出的化合物是具有式 (I-9m) 的化合物,其是具有式 (I-9) 的化合物,其中:

[0278] A_1 是CH₂或O;

[0279] R_2 是-CH₂CF₃、-CH₂CF₂CHF₂或-CH₂CF₂CF₃;

[0280] Q是选自由以下组成的组的基团:式Qa1和Qb1,其中

[0281] A_2 是N;并且

[0282] 当Q是Qa1时, Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N(CH₃)CO(环丙基)、-N(H)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CONH(CH₃)、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基;或者

[0283] 当Q是Qb1时, Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N(CH₃)CO(环丙基)、-N(H)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CONH(CH₃)、(噁唑烷-2-酮)-3-基、2-吡啶基氧基、吡啶-1-基、3-氯-吡啶-1-基、3-氰基-吡啶-1-基、3-三氟甲基-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

[0284] 根据此实施例的一组另外杰出的化合物是具有式 (I-9n) 的化合物,其是具有式

(I-9)的化合物,其中:

[0285] A_1 是 CH_2 或 O ;

[0286] R_2 是 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CF_2CHF_2$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$;优选地 $-CH_2CF_3$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$;

[0287] Q 是选自以下组成的组的基团:式 $Qa1$ 和 $Qb1$,其中

[0288] A_2 是 N ;并且

[0289] Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2-吡啶基氧基、3-氯-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或噁啶-2-基。

[0290] 根据此实施例的一组进一步杰出的化合物是具有式(I-9n-1)的化合物,其是具有式(I-9n)的化合物,其中:

[0291] Q_1 是氢、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2-吡啶基氧基、3-氯-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或噁啶-2-基。

[0292] 根据此实施例的一组进一步杰出的化合物是具有式(I-9o)的化合物,其是具有式(I-9)的化合物,其中:

[0293] A_1 是 CH_2 或 O ;

[0294] R_2 是 $-CH_2CF_3$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$;

[0295] Q 是基团 $Qa1$,其中

[0296] A_2 是 N ;并且

[0297] Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2-吡啶基氧基、3-氯-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或噁啶-2-基。

[0298] 根据此实施例的一组进一步杰出的化合物是具有式(I-9o-1)的化合物,其是具有式(I-9o)的化合物,其中:

[0299] Q_1 是氢、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2-吡啶基氧基、或3-氯-吡啶-1-基。

[0300] 根据此实施例的一组进一步杰出的化合物是具有式(I-9p)的化合物,其是具有式(I-9)的化合物,其中:

[0301] A_1 是 CH_2 或 O ;

[0302] R_2 是 $-CH_2CF_3$ 或 $-CH_2CF_2CF_3$;

[0303] Q 是基团 $Qb1$,其中

[0304] A_2 是 N ;并且

[0305] Q_1 是氢、氯、溴、三氟甲基、1-氟-1-甲基-乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2-吡啶基氧基、3-氯-吡啶-1-基、1,2,4-三唑-1-基或噁啶-2-基。

[0306] 根据此实施例的一组进一步杰出的化合物是具有式(I-9p-1)的化合物,其是具有式(I-9p)的化合物,其中:

[0307] Q_1 是环丙基、1,2,4-三唑-1-基或噁啶-2-基。

[0308] 根据本发明的化合物可以具有任何数量的益处,尤其包括对于保护植物抵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或环境特征曲线)。特别地,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*)。

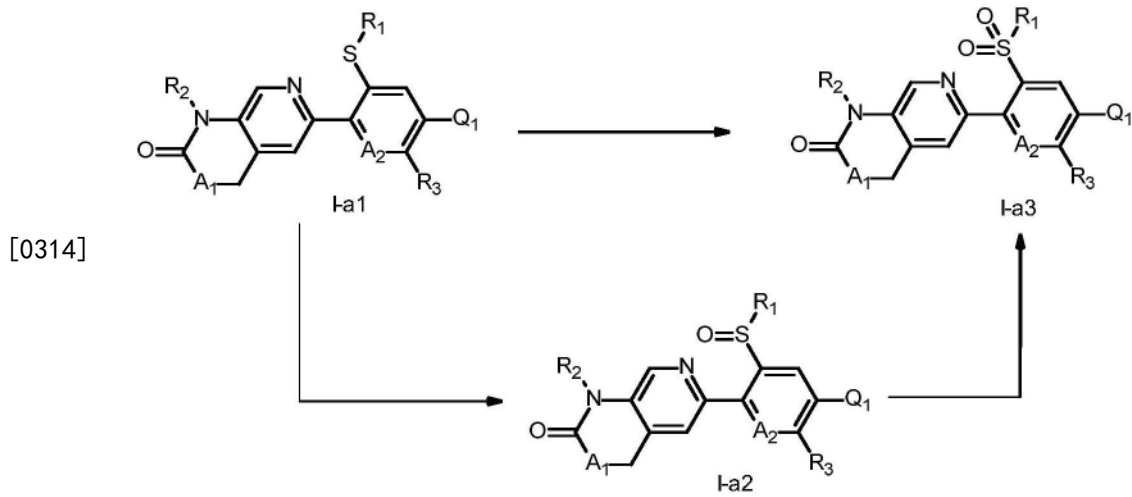
[0309] 在另一方面,本发明提供了一种组合物,该组合物包含杀昆虫、杀螨、杀线虫或杀软体动物有效量的如在具有式(I-1)、(I-2)、(I-3)、(I-4)、(I-5)、(I-6)、(I-7)、(I-8)和(I-9)的化合物(上文)下的实施例中任一项中定义的具有式(I)的化合物、或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,以及任选地,助剂或稀释剂。

[0310] 在另一方面,本发明提供了一种对抗并控制昆虫、螨、线虫或软体动物的方法,该方法包括向有害生物、有害生物的场所、或易受有害生物攻击的植物施用杀昆虫、杀螨、杀线虫或杀软体动物有效量的如在具有式(I-1)、(I-2)、(I-3)、(I-4)、(I-5)、(I-6)、(I-7)、(I-8)和(I-9)的化合物(上文)下的实施例中任一项中定义的具有式(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,或如上定义的组合物。

[0311] 在又另一方面,本发明提供一种用于保护植物繁殖材料免受昆虫、螨、线虫或软体动物攻击的方法,该方法包括用如上定义的组合物处理该繁殖材料或该繁殖材料所种植的场地。

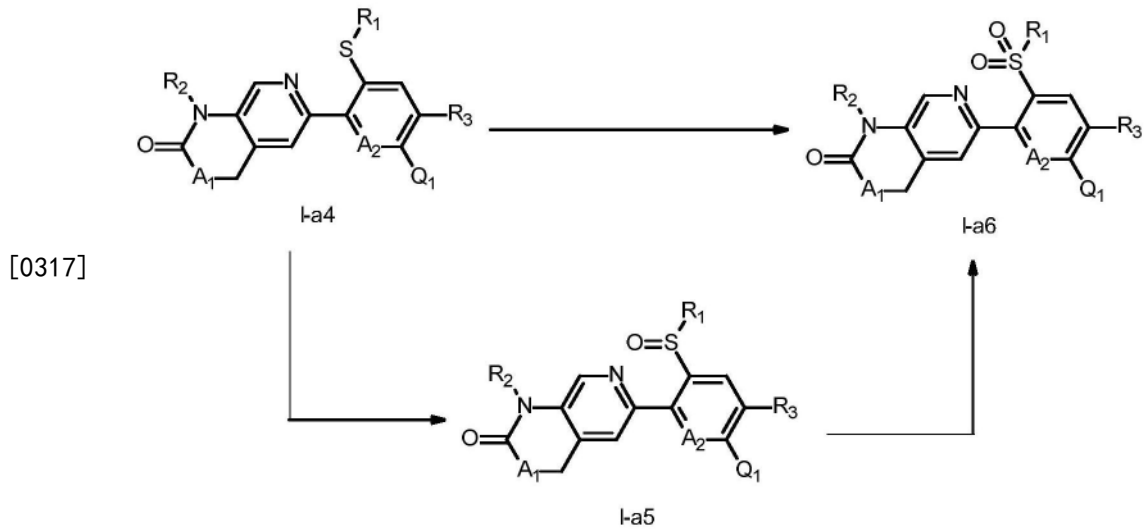
[0312] 根据本发明的用于制备具有式I的化合物的方法原则上通过本领域的技术人员已知的方法进行。更特别地,并且如方案1和方案2中所述,具有式I的化合物的亚组(其中X是SO(亚砷)和/或SO₂(砷))可以借助对应的具有式I的硫化物(其中X是S)的氧化反应来获得,该氧化反应涉及试剂例如像间氯过氧苯甲酸(mCPBA)、过氧化氢、oxone、高碘酸钠、次氯酸钠或次氯酸叔丁酯以及其他氧化剂。氧化反应通常是在溶剂存在下进行的。用于反应的溶剂的实例包括脂肪族卤代烃,如二氯甲烷和氯仿;醇,如甲醇和乙醇;乙酸;水;及其混合物。用于该反应的氧化剂的量相对于1摩尔的生成亚砷化合物I的硫化物化合物I通常为1摩尔至3摩尔,优选1摩尔至1.2摩尔,并且相对于1摩尔的生成砷化合物I的硫化物化合物I优选地为2摩尔至2.2摩尔的氧化剂。这样的氧化反应例如披露于WO 2013/018928中。

[0313] 方案1(如以上式I定义的取代基)



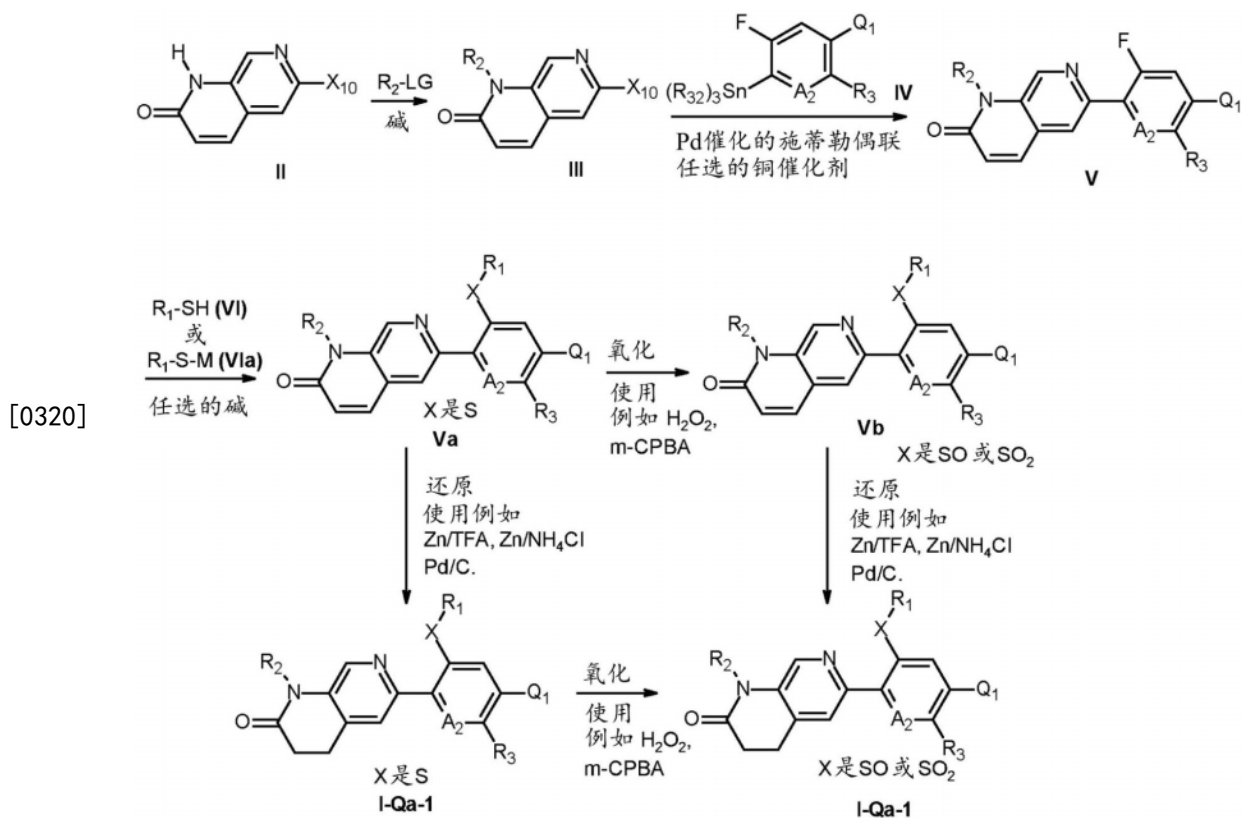
[0315] 先前在方案1中所述的由具有式I-a1的化合物得到具有式I-a2和式I-a3的化合物的化学过程可以类似地应用于(方案2)由具有式I-a4的化合物制备具有式I-a5和式I-a6的化合物,其中先前提到的所有取代基定义仍然有效。

[0316] 方案2



[0318] 具有式I的化合物的亚组(其中R₂是如式I中定义的并且其中Q是如Qa定义的,其中Q₁、R₃、X、A₂和R₁是如式I中定义的并且其中A₁是CH₂)可以被定义为具有式I-Qa-1的化合物(方案3)。

[0319] 方案3



[0321] 具有式I-Qa-1的化合物(其中X是SO或SO₂并且其中R₁、R₂、Q₁、A₂和R₃是如式I中定义的)可以由具有式Vb的化合物(其中X是SO或SO₂,并且其中R₁、R₂、Q₁、A₂和R₃是如式I中定义的),通过使用试剂(如锌粉和氯化铵,优选地饱和氯化铵水溶液),任选地在酸(优选地催化量,如三氟乙酸、盐酸等)存在下,在醚溶剂(如四氢呋喃或二噁烷)中,在0°C与回流条件之间的温度下进行还原反应来制备。可替代地,这样的还原还可以在本领域技术人员已知的条件下实现,例如通过使用分子氢(H₂),任选地在压力下,通常在催化剂(例如像雷尼镍)存在下,或使用转移氢化条件(例如,室温附近在四氢呋喃中的甲酸铵和5%-10%钯炭)。具有式Vb的化合物(其中X是SO或SO₂,并且其中R₁、R₂、Q₁、A₂和R₃是如式I中定义的)可以由具有式Va的化合物(其中X是S,并且其中R₁、R₂、Q₁、A₂和R₃是如式I中定义的),使用如方案1中所述的氧化反应来制备。可替代地,具有式I-Qa-1的化合物可以由具有式Va的化合物,通过涉及如上所述的相同的化学过程,但通过改变步骤的顺序(即,通过对Va(其中X是S)进行还原步骤以形成I-Qa-1(其中X是S),随后对I-Qa-1(其中X是S)进行氧化步骤以形成I-Qa-1(其中X是SO或SO₂))来制备。

[0322] 具有式Va的化合物(其中X是S,并且其中R₁、R₂、Q₁、A₂和R₃是如式I中定义的)可以通过使以下反应制备:具有式V的化合物(其中R₂、Q₁、A₂和R₃是如式I中定义的)与具有式VI的试剂

[0323] R₁-SH (VI),

[0324] 或其盐(其中R₁是如式I中定义的),任选地在适合的碱(如碱金属碳酸盐例如碳酸钠和碳酸钾,或碱金属氢化物如氢化钠,或碱金属氢氧化物如氢氧化钠和氢氧化钾,或叔丁醇钠或叔丁醇钾)存在下,在惰性溶剂中,在优选地在25°C-120°C之间的温度下。待使用的溶剂的实例包括醚,如四氢呋喃THF、乙二醇二甲醚、叔丁基甲基醚和1,4-二噁烷;芳香族

烃,如甲苯和二甲苯;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NMP或二甲亚砜。具有式VI的化合物的盐的实例包括具有式VIa的化合物

[0325] R_1-S-M (VIa),

[0326] 其中 R_1 是如上定义的并且其中M例如是钠或钾。由具有式V的化合物制备具有式Va的化合物的这样的方法可以例如在W0 16/091731中找到。

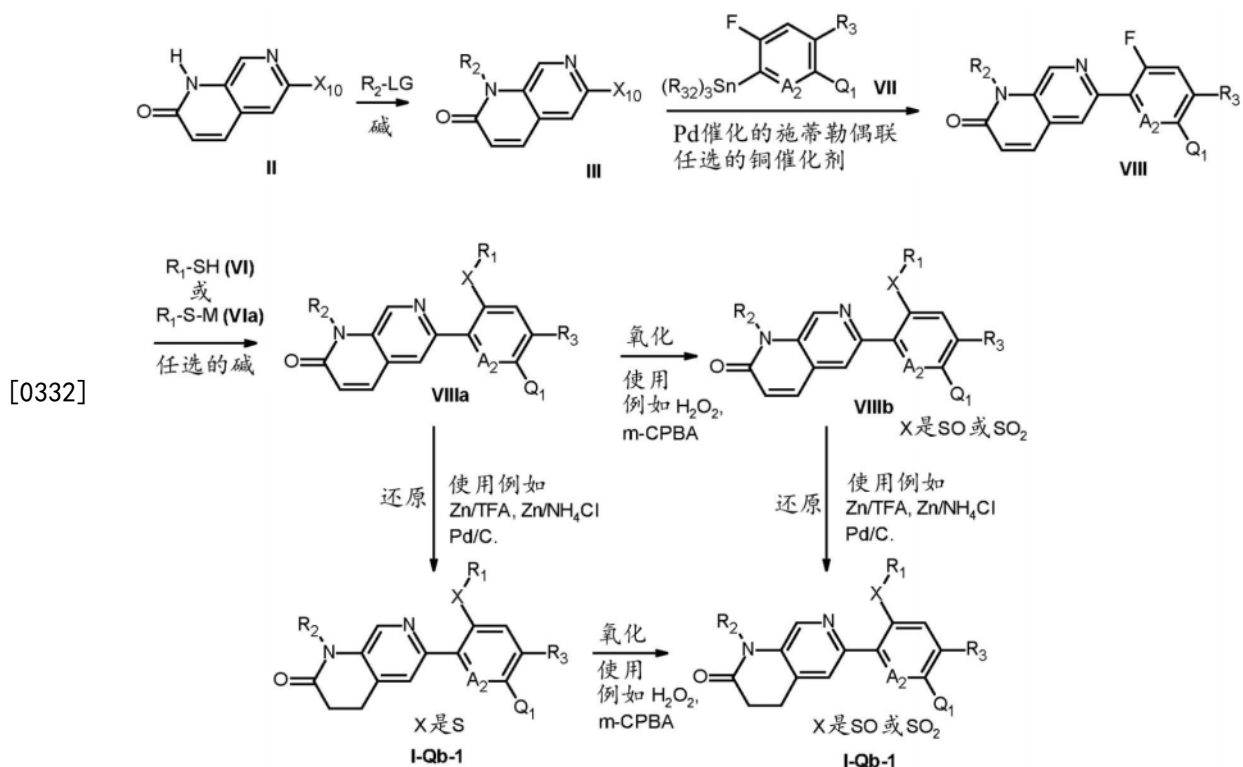
[0327] 可替代地,形成Va的此反应可以在钯催化剂(如三(二亚苄基丙酮)二钯(0))存在下,在膦配体(如Xanthphos)存在下,在惰性溶剂(例如,二甲苯)中,在100°C-160°C之间的温度(优选140°C)下进行,如在Tetrahedron[四面体]2005,61,5253-5259中所述的。

[0328] 具有式V的化合物(其中 R_2 、 Q_1 、 A_2 和 R_3 是如式I中定义的)可以通过具有式(IV)的化合物(其中 Q_1 、 A_2 和 R_3 是如上式I中定义的,并且其中 R_{32} 是 C_1 - C_{10} 烷基,优选地正丁基或甲基)与具有式III的化合物(其中 R_2 是如上式I中定义的,并且其中 X_{10} 是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯,如三氟甲磺酸酯)之间的施蒂勒(Stille)反应制备。这样的施蒂勒反应通常是在钯催化剂(例如四(三苯基膦)钯(0)、乙酸钯(II)或双(三苯基膦)氯化钯(II))存在下,并且在配体(如膦配体Xanthphos、XPhos等)存在下,在惰性溶剂(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(如氟化铯或氯化铯)存在下,并且任选地在另外的催化剂(例如碘化铜(I))存在下进行。这样的施蒂勒偶联也是本领域技术人员众所周知的,并且已经例如描述于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;以及Angew.Chem.Int.Ed.[应用化学国际版],2004,43,1132-1136中。

[0329] 具有式III的化合物(其中 R_2 是如上式I中定义的,并且其中 X_{10} 是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯,如三氟甲磺酸酯)可以通过使具有式II的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯))与具有式 R_2 -LG的试剂(其中 R_2 是如上式I中定义的,并且其中LG为卤素,优选为碘、溴或氯(或拟卤素离去基团,如(卤代)烷基或苯基磺酸酯,例如三氟甲磺酸酯))在碱(如氢化钠或碱土金属氢化物、碳酸盐(例如碳酸钠、碳酸钾或碳酸铯)或氢氧化物)存在下,在惰性溶剂(如四氢呋喃、二噁烷,N,N-二甲基甲酰胺DMF、N,N-二甲基乙酰胺或乙腈等)中,在0°C与120°C之间的温度下,通过本领域技术人员众所周知的程序进行反应来制备,并且其描述于例如W0 21/136722中。

[0330] 具有式I的化合物的亚组(其中 R_2 是如上式I中定义的并且其中Q是如Qb定义的,其中 Q_1 、 R_3 、 X 、 A_2 和 R_1 是如上式I中定义的并且其中 A_1 是 CH_2)可以被定义为具有式I-Qb-1的化合物(方案4)。

[0331] 方案4



[0333] 先前在方案3中所述的由具有式II的化合物得到具有式I-Qa-1的化合物的化学过程可以类似地应用于(方案4)由具有式III的化合物制备具有式I-Qb-1的化合物,其中先前提到的所有取代基定义仍然有效。

[0334] 具有式VI的化合物(其中 R_1 是如式I中定义的)以及具有式VIa的化合物(其中 R_1 是如上定义的并且其中M是例如钠或钾)是已知的、可商购的或可以通过本领域技术人员已知的方法来制备。

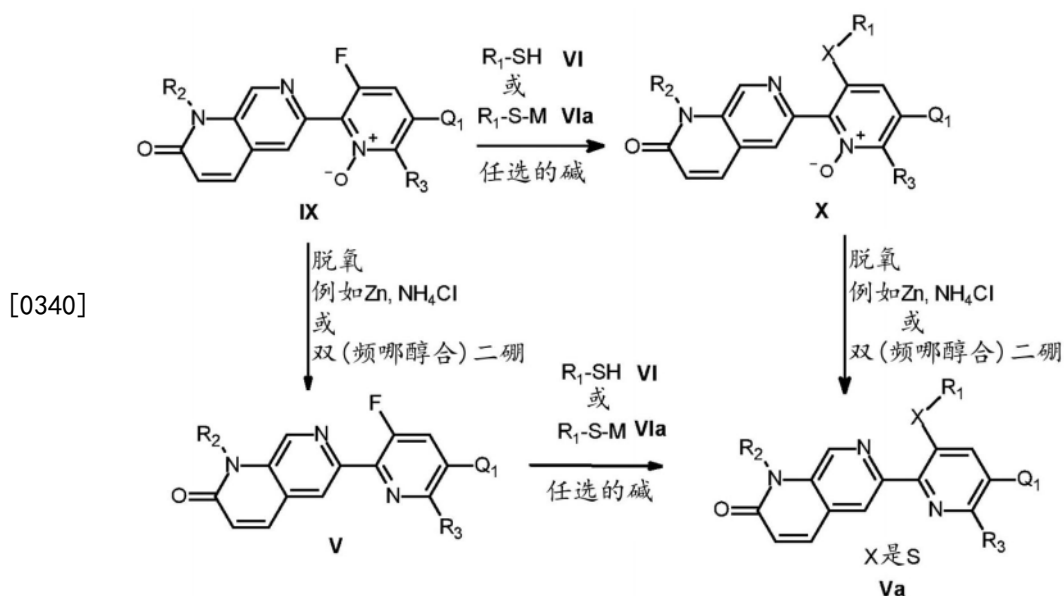
[0335] 具有式IV的化合物和具有式VII的化合物(其中 Q_1 、 A_2 和 R_3 是如上式I中定义的,并且其中 R_{32} 是 C_1 - C_{10} 烷基,优选地正丁基或甲基);和

[0336] 具有式 R_2 -LG的试剂(其中 R_2 是如式I中定义的,并且其中LG是卤素,优选碘、溴或氯(或拟卤素离去基团,如(卤代)烷基或苯基磺酸酯,例如三氟甲磺酸酯));

[0337] 是已知的、可商购的或可以通过本领域技术人员已知的方法来制备。

[0338] 可替代地,具有式Va的化合物(其中 R_1 、 R_2 、 R_3 、 Q_1 和X是如上式I中定义的,并且其中 A_2 是N)可以按照方案5来制备。

[0339] 方案5



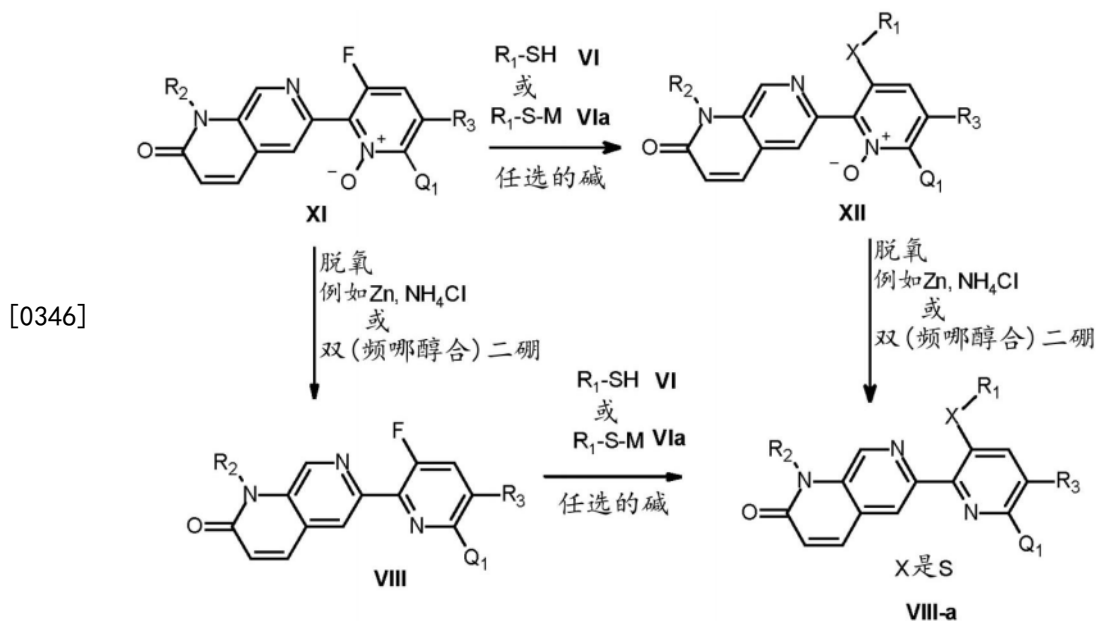
[0341] 具有式Va的化合物(其中 R_1 、 R_2 、 R_3 、和 Q_1 是如上式I中定义的,并且其中 A_2 是N并且X是S)可以通过使用试剂(如锌粉和氯化铵,优选地饱和氯化铵水溶液),在醚溶剂(如四氢呋喃或二噁烷)中,在 0°C 与回流条件之间的温度下使具有式X的化合物(其中X是S,并且其中 R_1 、 R_2 、 Q_1 、和 R_3 是如上式I中定义的)脱氧来制备(方案5)。可替代地,这样的还原也可以在本领域技术人员已知的条件下实现,例如通过在乙酸中包含铁粉,或者使用分子氢(H_2),任选在压力下,通常在催化剂(例如像雷尼镍)存在下,或使用转移氢化条件(例如,室温附近在四氢呋喃中的甲酸铵和5%-10%钯炭),或使用在例如乙腈中的双(频哪醇合)二硼(4,4,5,5-四甲基-2-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷-2-基)-1,3,2-二氧杂环戊硼烷)或使用磷基试剂,如三氯化磷、亚磷酸三乙酯或三苯基膦。

[0342] 具有式X的化合物(其中X是S,并且其中 R_1 、 R_2 、 Q_1 和 R_3 是如上式I中定义的)可以由具有式IX的化合物(其中 R_2 、 R_3 和 Q_1 是如上式I中所述的)通过如方案3中所述的用于由具有式V的化合物制备具有式Va的化合物的类似程序制备。IX至X和X至Va的两种转化均描述于例如WO 21/136722中。

[0343] 可替代地,具有式Va的化合物(其中X是S)可以由具有式IX的化合物通过涉及与如上所述的相同的化学过程,但通过改变这些步骤的顺序(即,通过运行序列IX至V(经由脱氧/还原),随后是V与VI或VIa的反应以形成Va,其中先前提到的所有取代基定义仍然有效)制备。

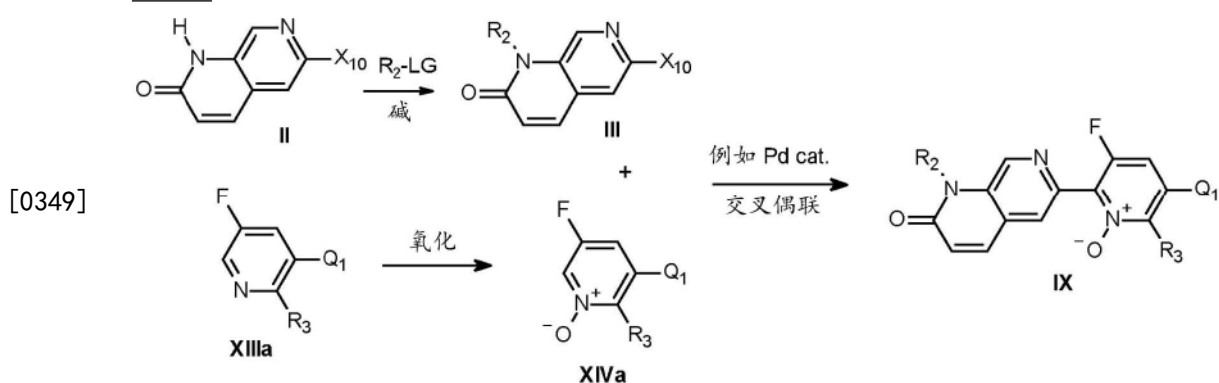
[0344] 可替代地,具有式VIII-a的化合物(方案4中所述的)可以由先前在方案5中所述的由具有式IX的化合物得到具有式Va的化合物的化学过程制备并且可以类似地应用于(方案6)由具有式XI的化合物制备具有式VIII-a的化合物,其中先前提到的所有取代基定义仍然有效。

[0345] 方案6



[0347] 具有式IX的化合物(其中 R_2 、 Q_1 和 R_3 是如式I中定义的)

[0348] 方案7



[0350] 可以通过在金属催化(优选钯催化)条件(例如涉及[1,1'双(二苯基膦基)二茂铁]二氯化钯($\text{PdCl}_2(\text{dppf})$),任选地作为与二氯甲烷的络合物(优选1:1络合物)下,在碱(如2,2,6,6-四甲基哌啶化物氯化锌氯化锂($\text{TMPZnCl} \cdot \text{LiCl}$; 商业的或根据Org.Lett.[有机快报]2009,11,1837-1840制备的),优选呈四甲基哌啶基氯化锌氯化锂络合物在四氢呋喃中的溶液的形式)存在下,在醚溶剂(如四氢呋喃、二噁烷或1,2-二甲氧基乙烷,优选地四氢呋喃)中,在 0°C 与回流条件之间(优选在室温与 80°C 之间)的温度下,优选在惰性气氛下,并且任选地在微波辐射下通过具有式III的化合物(其中 R_2 是如上式I中定义的并且其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选地溴或氯)与具有式XIVa的化合物(其中 Q_1 和 R_3 是如式I中定义的)之间的交叉偶联反应来制备(方案7)。这样的交叉偶联条件已描述于例如Org.Lett.[有机快报]2012,14,862-865或WO 21/136722中。

[0351] 可替代地,此交叉偶联步骤也可以在Fagnou型条件(由Fagnou等人描述于例如Org.Lett.[有机快报]2011,13,2310-13和J. Am. Chem. Soc.[美国化学会志]2009,131,3291-3306)(涉及乙酸钯和膦配体如三叔丁基膦四氟硼酸盐($\text{PtBu}_3\text{-HBF}_4$))下,在碱(如碳酸钾或碳酸铯)存在下,在溶剂(如四氢呋喃、二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺或甲苯)中,在 0°C 与 150°C 之间(优选在室温与 120°C 之间)的温度下,优选在惰性气氛下,并且任选微波辐

射下进行。

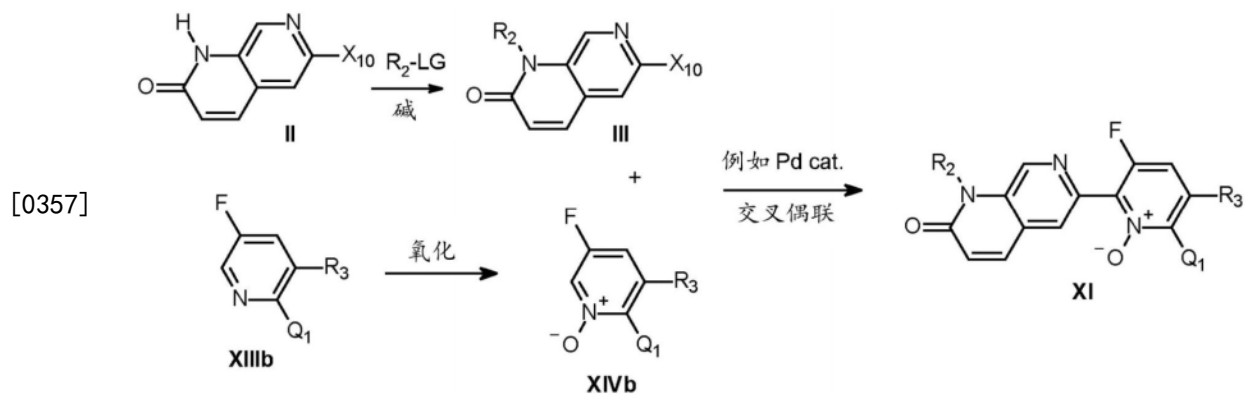
[0352] 具有式III的化合物(其中 R_2 是如上式I中定义的,并且其中 X_{10} 是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯,如三氟甲磺酸酯)可以通过使具有式II的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯))与具有式 R_2 -LG的试剂(其中 R_2 是如上式I中定义的,并且其中LG为卤素,优选为碘、溴或氯(或拟卤素离去基团,如(卤代)烷基或苯基磺酸酯,例如三氟甲磺酸酯))在碱(如氢化钠或碱土金属氢化物、碳酸盐(例如碳酸钠、碳酸钾或碳酸铯)或氢氧化物)存在下,在惰性溶剂(如四氢呋喃、二噁烷,N,N-二甲基甲酰胺DMF、N,N-二甲基乙酰胺或乙腈等)中,在0°C与120°C之间的温度下,通过本领域技术人员众所周知的程序进行反应来制备。

[0353] 具有式XIVa的化合物(其中 Q_1 和 R_3 是如上式I中定义的)可以在本领域技术人员已知的条件(涉及例如间氯过苯甲酸)下,在惰性溶剂(如乙酸乙酯、氯仿或二氯甲烷)中,在0°C与80°C之间(优选10°C至70°C)的温度下,通过氧化具有式XIIIa的化合物(其中 Q_1 和 R_3 是如上式I中定义的)来制备。可替代地,可以使用其他适合的氧化剂,例如像甲基三氧铈和过氧化氢(含水或作为络合物),乙酸中的过氧化氢,或在酸酐(例如三氟乙酸酐)存在下的 H_2O_2 /脲加合物。这样的氧化从文献,例如从J. Med. Chem. [药物化学杂志]1989,32,2561、WO 00/15615、WO 20/182577或WO 21/136722已知。

[0354] 具有式XIIIa的化合物(其中 Q_1 和 R_3 是如上式I中定义的)是已知的、可商购的、或可以通过本领域技术人员已知的方法制备或通过例如在WO 20/182577中找到的说明类似地制备。

[0355] 先前在方案7中所述的得到具有式IX的化合物的化学过程可以类似地应用于(方案8)制备具有式XI的化合物,其中先前提到的所有取代基定义仍然有效。

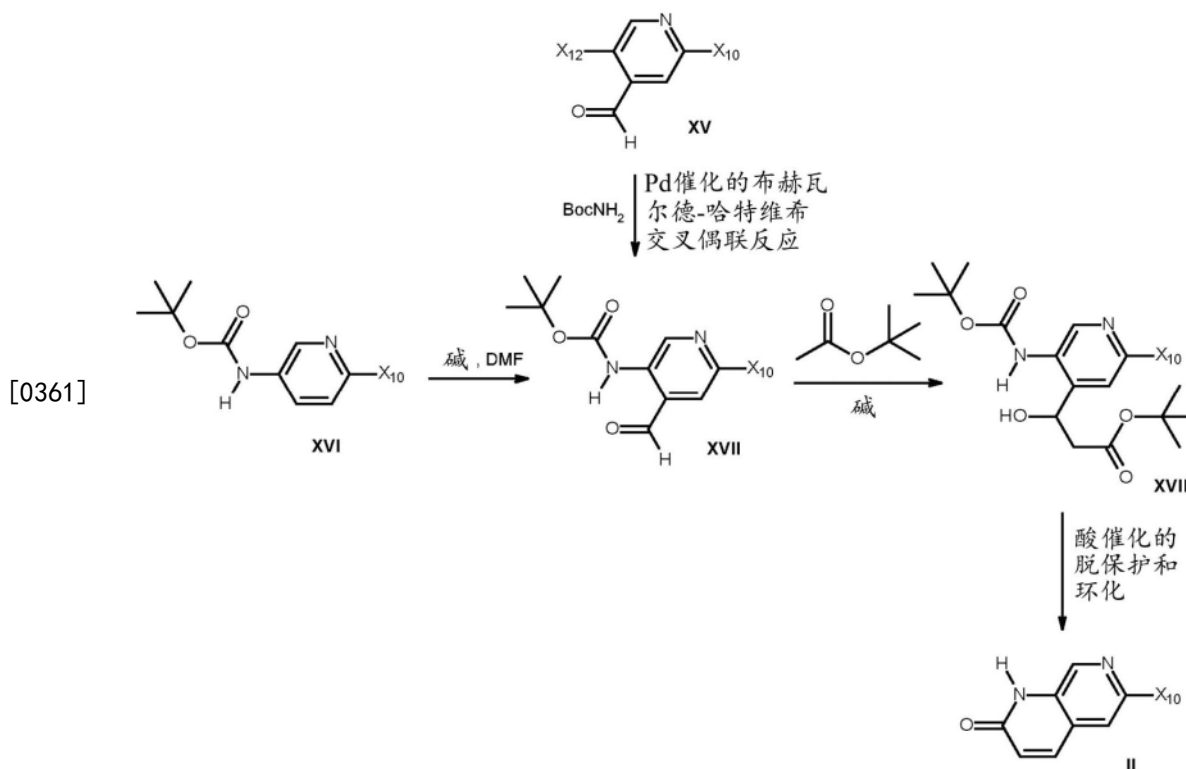
[0356] 方案8:



[0358] 具有式XIIIb的化合物(其中 Q_1 和 R_3 是如上式I中定义的)是已知的、可商购的、或可以通过本领域技术人员已知的方法制备。

[0359] 具有式II的化合物可以按照方案9制备。

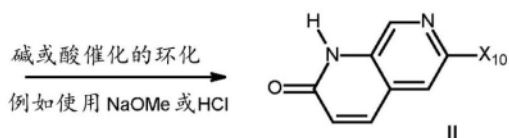
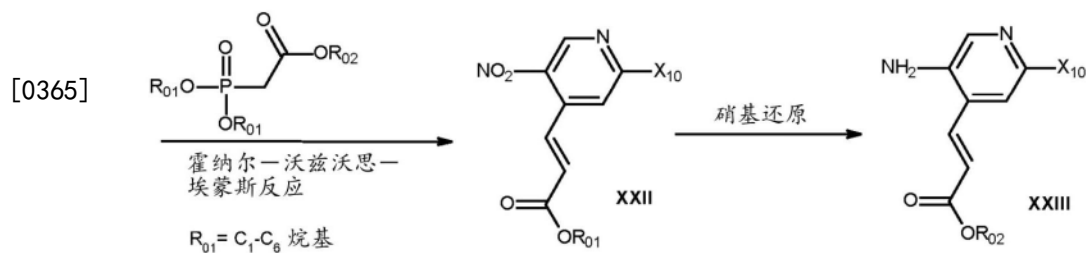
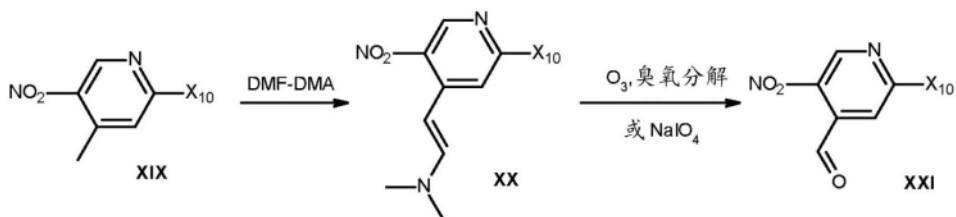
[0360] 方案9



[0362] 具有式II的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选溴或氯)可以通过BOC-官能团(叔丁氧基羰基)的酸催化脱保护和随后的胺和羧酸分子内环化形成羧酰胺来制备(方案9)。这样的反应可以在酸如三氟乙酸、盐酸、硫酸等存在下,并且任选地在溶剂如卤代溶剂像二氯甲烷、二氯乙烷、水等存在下并且在室温与溶剂或试剂的沸点之间的温度下进行。具有式XVIII的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选溴或氯)可以通过具有式XVII的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选溴或氯)与乙酸叔丁酯在适合的碱(如 $n\text{-BuLi}$ 、二异丙基氨基锂、 Li-TMP 等)存在下并且在溶剂如四氢呋喃、二噁烷、二甲基甲酰胺等存在下并且在 -78°C 与溶剂沸点之间的温度下的反应制备。具有式XVII的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选溴或氯)可以通过具有式XVI的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选溴或氯)使用碱(如 $n\text{-BuLi}$ 、二异丙基氨基锂、 Li-TMP)的金属化以及随后与DMF在溶剂如四氢呋喃、二噁烷、二甲基甲酰胺存在下反应制备。这样的反应例如在J.Org.Chem.[有机化学杂志]1990,55,4744中已知。可替代地,具有式XVII的化合物可以通过具有式XV的化合物(其中 X_{10} 和 X_{12} 独立地是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选溴或氯)与氨基甲酸叔丁酯(BOCNH_2)之间的钯催化的选择性布赫瓦尔德-哈特维希(Buchwald-Hartwig)交叉偶联反应来制备。这样的反应可以在金属催化剂(优选钯催化剂)如 $[1,1'\text{-双(二苯基膦基)二茂铁}]_2\text{氯化钯}(\text{PdCl}_2(\text{dppf}))$ 或 $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ 存在下并且在配体(如三丁基膦、 dppf 、 Xantphos 、 XPhos)存在下并在碱(如叔丁醇钠、碳酸钾、碳酸铯、碳酸钠)存在下,并且在溶剂(如四氢呋喃、二噁烷或1,2-二甲氧基乙烷、甲苯)存在下,并且在 0°C 与回流条件之间的温度下,优选在惰性气氛下,并且任选地在微波辐射下进行。这样的反应在文献中是众所周知的,并且例如描述于Chem.Rev.[化学综述]2016,116,19,12564-12649;和J.Org.Chem.[有机化学杂志]1999,64,15,5575-5580中。

[0363] 可替代地,具有式II的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选溴或氯)

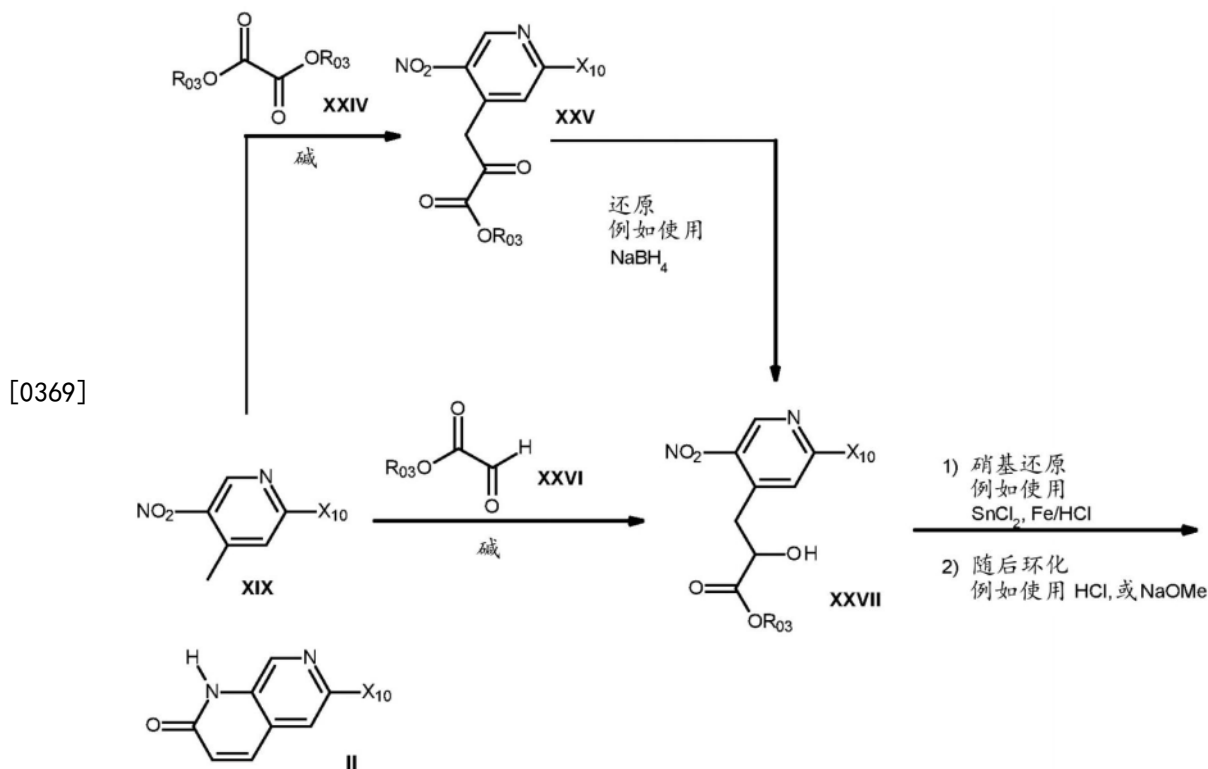
[0364] 方案10



[0366] 可以按照方案10并类似于如WO 2000/049015中描述的程序来制备。

[0367] 可替代地,具有式II的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选溴或氯)

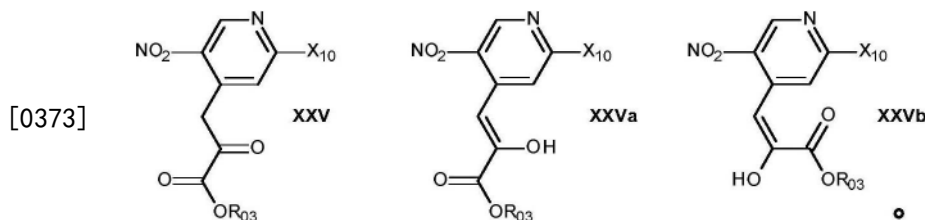
[0368] 方案11



[0370] 可以由具有式XXVII的化合物(其中X₁₀是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选溴或氯,并且其中R₀₃是C₁-C₆烷基、苄基、或芳基基团)在酸催化剂(如乙酸、盐酸HCl、硫酸H₂SO₄、或三氟乙酸TFA)存在下,任选地在溶剂(如四氢呋喃或二噁烷)存在下或在碱(如甲醇钠)存在下,经由硝基还原和随后的分子内环化制备(方案11)。

[0371] 硝基还原典型地使用试剂如氯化铵存在下的铁、乙酸存在下的铁、Sn/HCl或四羟基二硼等并且在0℃至反应混合物的沸点之间的温度下。这样的反应在文献中是已知的并且例如描述于例如Synthesis[合成],2018,50,1765-1768;Org.Lett.[有机快报]2014,16,19,5192-5195;Organic Letters[有机快报](2019),21(9),3465-3469;以及Synthetic Communications[合成通讯],2007,37,2777-2786中。

[0372] 具有式XXV的化合物可能以不同的互变异构形式存在,如XXVa和/或XXVb:



[0374] 本发明覆盖所有这样的异构体和互变异构体及其所有比例的混合物。

[0375] 具有式XXVII的化合物(其中X₁₀是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选溴或氯,并且其中R₀₃是C₁-C₆烷基、苄基或芳基)可以通过以下方式制备:在碱(如叔丁醇钾、甲醇钠、乙醇钠、氢化钠、正丁基锂、1,8-二氮杂双环(5.4.0)十一碳-7-烯(DBU)、二异丙基氨基锂以及其他类似碱)存在下,任选地在溶剂如四氢呋喃、甲醇、二噁烷、乙醇、DMF存在下,并且在-78℃至反应混合物的沸点之间的温度下使具有式XIX的化合物(其中X₁₀是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选溴或氯)与具有式XXVI的化合物(其中R₀₃是C₁-C₆烷基、苄基或芳基)进行反应。

[0376] 可替代地,具有式XXVII的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选溴或氯,并且其中 R_{03} 是 C_1-C_6 烷基、苄基或芳基)可以由具有式XIX的化合物以两个步骤制备。第一步涉及在碱(如叔丁醇钾、甲醇钠、乙醇钠、氢氧化钠、正丁基锂、1,8-二氮杂双环(5.4.0)十一碳-7-烯(DBU)、二异丙基氨基锂以及其他类似的碱)存在下,任选地在溶剂(如四氢呋喃、甲醇、二噁烷、乙醇、DMF)存在下,并且在 -78°C 至反应混合物的沸点之间的温度下使具有式XIX的化合物与具有式XXIV的化合物(其中 R_{03} 是 C_1-C_6 烷基、苄基或芳基)进行反应。并且第二步涉及在还原剂(如硼基还原剂,例如硼氢化钠、硼烷,或铝基试剂,例如二异丁基氢化铝或氢化铝锂)存在下,在溶剂(如四氢呋喃、甲醇、二噁烷或乙醇)存在下,任选地在具有水的混合物中,并且在优选地 0°C 与 30°C 之间的温度下,具有式XXV的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选溴或氯,并且其中 R_{03} 是 C_1-C_6 烷基、苄基或芳基)的羰基还原。这两个步骤程序是文献中已知的,例如如WO 2005/044802中所述的。

[0377] 沿着路径XIX至XXV至XXVII至II的具有式II的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选地溴或氯)的制备(方案11)描述于例如WO 21/136722中。

[0378] 具有式XV的化合物(其中 X_{10} 和 X_{12} 独立地是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选溴或氯);和

[0379] 具有式XVI的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选溴或氯);和

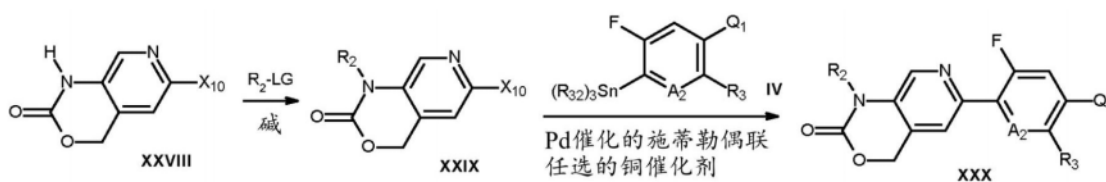
[0380] 具有式XIX的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选溴或氯);以及

[0381] 具有式XXIV和XXVI的化合物(其中 R_{03} 是 C_1-C_6 烷基、苄基或芳基);

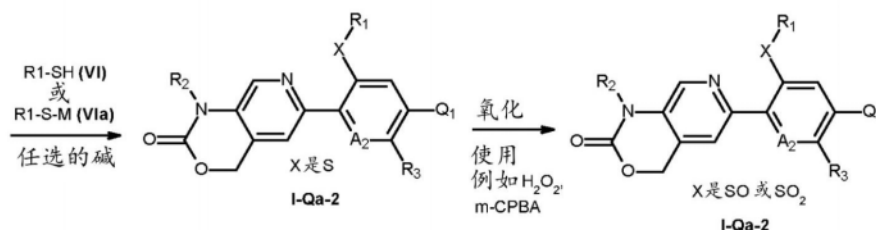
[0382] 是已知的、可商购的、或可以通过本领域技术人员已知的方法来制备。

[0383] 具有式I的化合物的亚组(其中 R_2 是如式I中定义的并且其中Q是如Qa定义的,其中 Q_1 、 R_3 、X、 A_2 和 R_1 是如式I中定义的并且其中 A_1 是O)可以被定义为具有式I-Qa-2的化合物(方案12)。

[0384] 方案12



[0385]



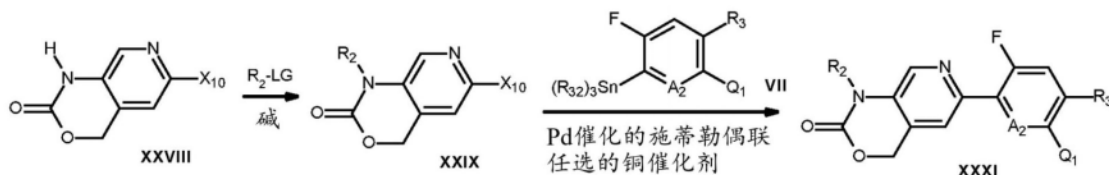
[0386] 具有式I-Qa-2的化合物(其中X、 R_1 、 R_2 、 Q_1 、 A_2 和 R_3 是如式I中定义的)可以通过按照如用于由具有式II的化合物制备具有式I-Qa-1的化合物的方案3中所述的类似程序(但分别省略还原步骤Va、Vb至I-Qa-1)由具有式XXVIII的化合物制备,其中先前提到的所有取代

基定义仍然有效。

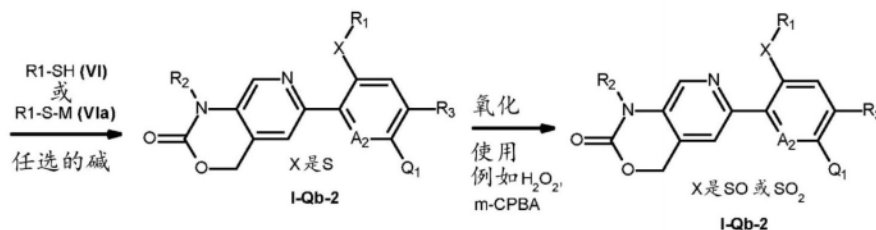
[0387] 具有式I的化合物的亚组(其中 R_2 是如式I中定义的并且其中Q是如Qb定义的,其中 Q_1 、 R_3 、X、 A_2 和 R_1 是如式I中定义的并且其中 A_1 是O)可以被定义为具有式I-Qb-2的化合物(方案13)。

[0388] 先前在方案12中所述的由具有式XXVIII的化合物得到具有式I-Qa-2的化合物的化学过程可以类似地应用于(方案13)由具有式XXVIII的化合物制备具有式I-Qb-2的化合物,其中先前提到的所有取代基定义仍然有效。

[0389] 方案13

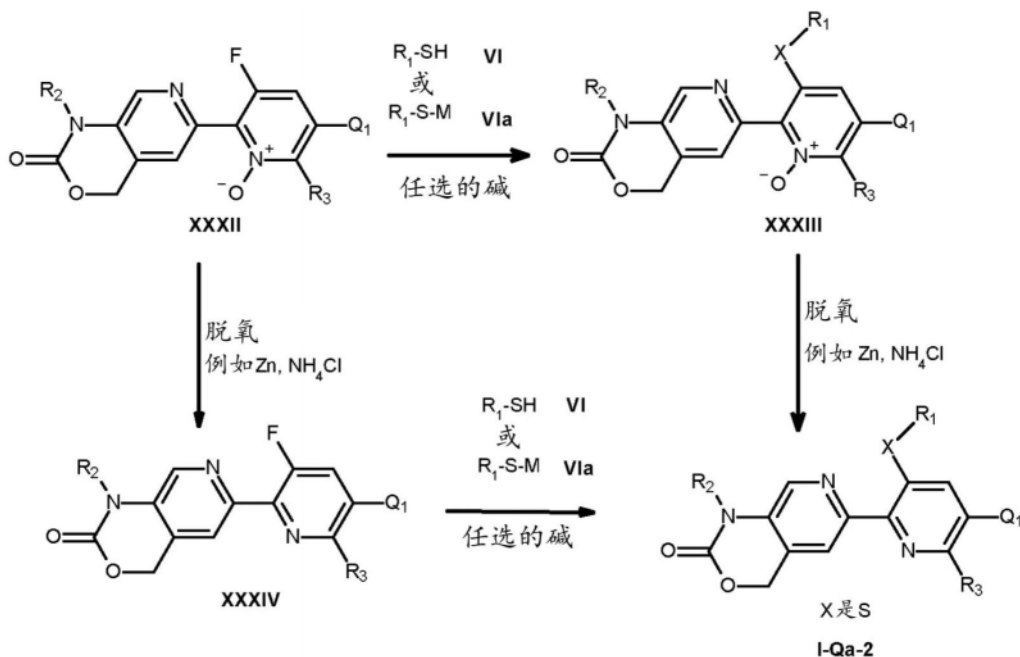


[0390]



[0391] 可替代地,具有式I-Qa-2的化合物(其中 R_1 、 R_2 、 R_3 、 Q_1 和X是如上式I中定义的,并且其中 A_2 是N)可以按照类似于用于由具有式IX的化合物制备具有式Va的化合物的方案5中所述的程序的方案14来制备。

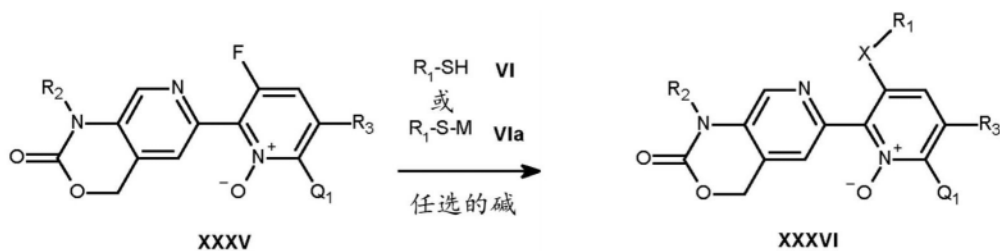
[0392] 方案14



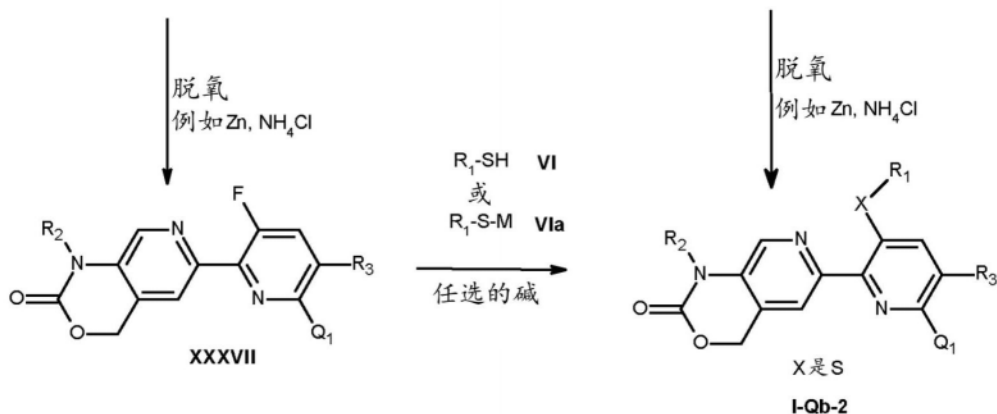
[0393]

[0394] 先前在方案14中所述的由具有式XXXII的化合物得到具有式I-Qa-2的化合物的化学过程可以类似地应用于(方案15)由具有式XXXV的化合物制备具有式I-Qb-2的化合物,其中先前提到的所有取代基定义仍然有效。

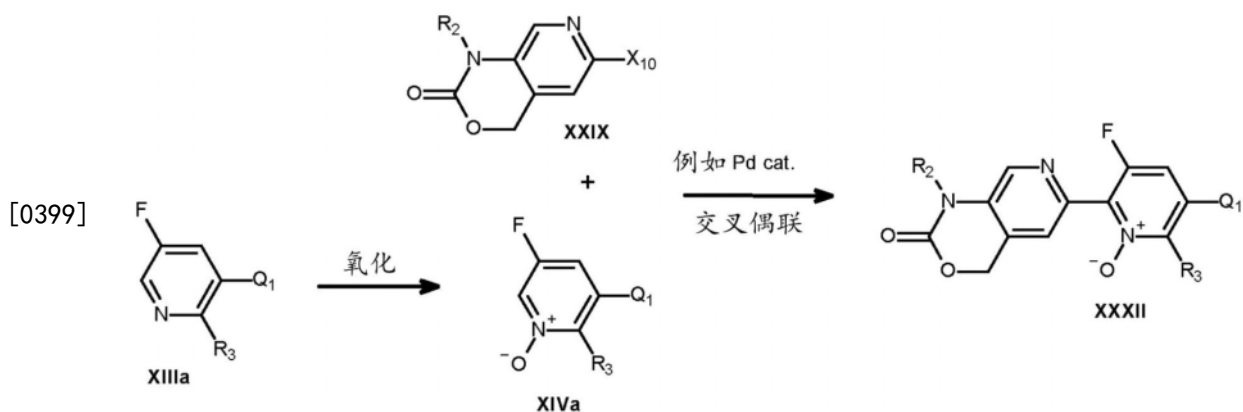
[0395] 方案15



[0396]

[0397] 具有式XXXII的化合物(其中 R_2 、 Q_1 和 R_3 是如式I中定义的)

[0398] 方案16



[0400] 可以通过在金属催化(优选钯催化)条件(例如涉及[1,1'双(二苯基膦基)二茂铁]二氯化钯($\text{PdCl}_2(\text{dppf})$),任选地作为与二氯甲烷的络合物(优选1:1络合物)下,在碱(如2,2,6,6-四甲基哌啶化物氯化锌氯化锂($\text{TMPZnCl} \cdot \text{LiCl}$;商业的或根据Org.Lett.[有机快报]2009,11,1837-1840制备的),优选呈四甲基哌啶基氯化锌氯化锂络合物在四氢呋喃中的溶液的形式)存在下,在醚溶剂(如四氢呋喃、二噁烷或1,2-二甲氧基乙烷,优选地四氢呋喃)中,在 0°C 与回流条件之间(优选在室温与 80°C 之间)的温度下,优选在惰性气氛下,并且任选地在微波辐射下通过具有式XXIX的化合物(其中 R_2 是如上式I中定义的并且其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选地溴或氯)与具有式XIVa的化合物(其中 Q_1 和 R_3 是如式I中定义的)之间的交叉偶联反应来制备(方案16)。这样的交叉偶联条件已描述于例如Org.Lett.[有机快报]2012,14,862-865和类似地W0 21/136722中。

[0401] 可替代地,此交叉偶联步骤也可以在Fagnou型条件(由Fagnou等人描述于例如Org.Lett.[有机快报]2011,13,2310-13和J.Am.Chem.Soc.[美国化学会志]2009,131,3291-3306)(涉及乙酸钯和膦配体如三叔丁基膦四氟硼酸盐($\text{PtBu}_3\text{-HBF}_4$))下,在碱(如碳酸

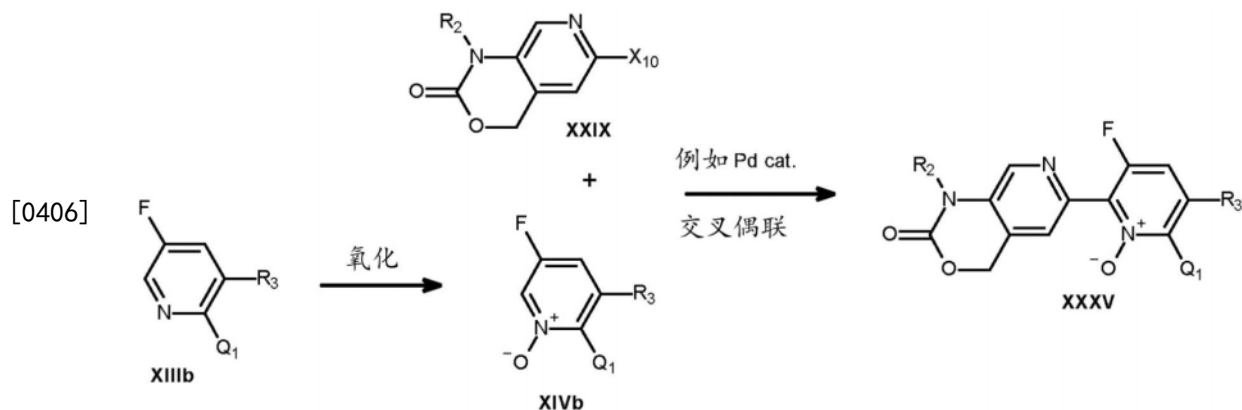
钾或碳酸铯)存在下,在溶剂(如四氢呋喃、二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺或甲苯)中,在0℃与150℃之间(优选在室温与120℃之间)的温度下,优选在惰性气氛下,并且任选微波辐射下进行。

[0402] 具有式XIVa的化合物(其中 Q_1 和 R_3 是如式I中定义的)可以在本领域技术人员已知的条件(涉及例如间氯过苯甲酸)下,在惰性溶剂(如乙酸乙酯、氯仿或二氯甲烷)中,在0℃与80℃之间(优选10℃至70℃)的温度下,通过氧化具有式XIIIa的化合物(其中 Q_1 和 R_3 是如式I中定义的)来制备。可替代地,可以使用其他适合的氧化剂,例如像甲基三氧铈和过氧化氢(含水或作为络合物),乙酸中的过氧化氢,或在酸酐(例如三氟乙酸酐)存在下的 H_2O_2 /脲加合物。这样的氧化从文献,例如从J. Med. Chem. [药物化学杂志] 1989, 32, 2561、W0 00/15615、W0 20/182577或W0 21/136722已知。

[0403] 具有式XIIIa的化合物(其中 Q_1 和 R_3 是如式I中定义的)是已知的、可商购的、或可以通过本领域技术人员已知的方法制备或通过例如在W0 20/182577中找到的说明类似地制备。

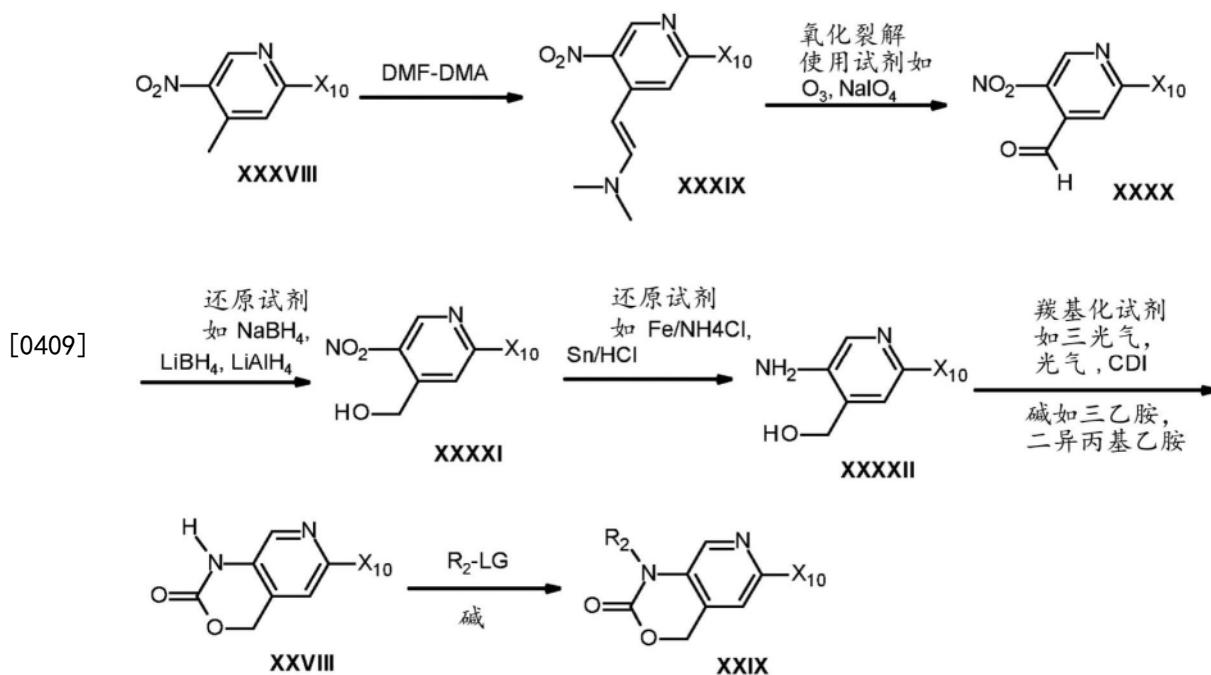
[0404] 先前在方案16中所述的由具有式XXIX的化合物得到具有式XXXII的化合物的化学过程可以类似地应用于由具有式XXIX的化合物制备具有式XXXV的化合物(方案17),其中先前提到的所有取代基定义仍然有效。

[0405] 方案17



[0407] 具有式XXIX的化合物(其中 R_2 如上式I中定义的,并且其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选地溴或氯)可以按照方案18制备。

[0408] 方案18



[0410] 在方案18中,具有式XXIX的化合物(其中 R_2 是如上式I中定义的,并且其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯),优选地溴或氯)可以通过使具有式XXVIII的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯))与具有式 R_2-LG 的试剂(其中 R_2 是如上式I中定义的,并且其中LG为卤素,优选地碘、溴或氯(或拟卤素离去基团,如(卤代)烷基或苯基磺酸酯,例如三氟甲磺酸酯))在碱(如氢化钠或碱土金属氢化物、碳酸盐(例如碳酸钠、碳酸钾或碳酸铯)或氢氧化物)存在下,在惰性溶剂(如四氢呋喃、二噁烷,N,N-二甲基甲酰胺DMF、N,N-二甲基乙酰胺或乙腈等)中,在 0°C 与 120°C 之间的温度下,通过本领域技术人员众所周知的程序进行反应来制备。

[0411] 具有式XXVIII的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯))可以通过使具有式XXXXII的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯))与羰基化试剂(CO源)(如光气、三光气(双(三氯甲基)碳酸酯)或羰基二咪唑CDI),在碱(如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺或碳酸钾等)存在下,在溶剂(如二噁烷、四氢呋喃或二氯甲烷等)存在下,并且在 -20°C 至反应混合物的沸点之间的温度下进行反应来制备。这样的反应在文献中是已知的并且例如描述于Tetrahedron Letters[四面体快报]53(2012)4892-4895中。

[0412] 具有式XXXXII的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯))可以由具有式XXXXI的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯))经由使用试剂(如氯化铵存在下的铁、Sn/HCl或四羟基二硼等)的硝基还原,并且在 0°C 至反应混合物的沸点之间的温度下来制备。该反应可以在溶剂(如甲醇、乙醇、四氢呋喃、或二噁烷(任选地与水的混合物))存在下进行。这样的反应在文献中是已知的并且例如描述于例如Synthesis[合成],2018,50,1765-1768;Org.Lett.[有机快报]2014,16,19,5192-5195;Organic Letters[有机快报](2019),21(9),3465-3469;以及Synthetic Communications[合成通讯],2007,37,2777-2786中。

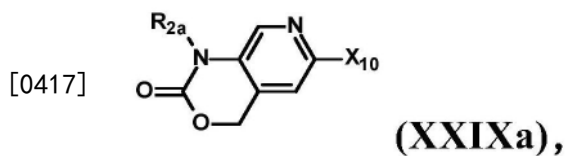
[0413] 具有式XXXXI的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯))可以由具有式XXXX的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯))经由醛官能度的还原和通过使用还原试剂来制备。这样的还原试剂的实例包括例如硼氢化钠、硼氢

化锂和氢化铝锂。该反应可以在溶剂(如甲醇、乙醇、四氢呋喃或二氯甲烷)存在下,并且在-78°C至反应混合物的沸点之间的温度下进行。这样的反应在文献中是已知的并且例如描述于European Journal of Organic Chemistry[欧洲有机化学杂志](2009), (21), 3567-3572, Org. Lett. [有机快报]2014, 16, 19, 5192-5195中。

[0414] 具有式XXXX的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯))可以由式XXXIX的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯)),经由使用试剂(如高碘酸钠或臭氧)的烯胺官能度的氧化裂解(也参见方案10),在溶剂(如四氢呋喃或二噁烷(任选地与水的混合物))中,并且例如在0°C与30°C之间的温度下来制备。

[0415] 具有式XXXIX的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯))可以通过使具有式XXXVIII的化合物(其中 X_{10} 是卤素(或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯))与N,N-二甲基甲酰胺二甲基缩醛(DMF-DMA或1,1-二甲氧基-N,N-二甲基甲胺),任选地在碱催化剂或介体(如1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯)存在下,并且任选地在溶剂(如N,N-二甲基甲酰胺、四氢呋喃或乙腈)存在下,并且在0°C至反应混合物的沸点或N,N-二甲基甲酰胺二甲基缩醛的沸点之间的温度下反应来制备。具有式XXXVIII的化合物向具有式XXXX的化合物的这种两步转化在文献中是已知的并且描述于例如Tetrahedron Letters [四面体快报], 1994, 第335卷第2期, 219-222中。

[0416] 具有式XXIXa的化合物



[0418] 其中

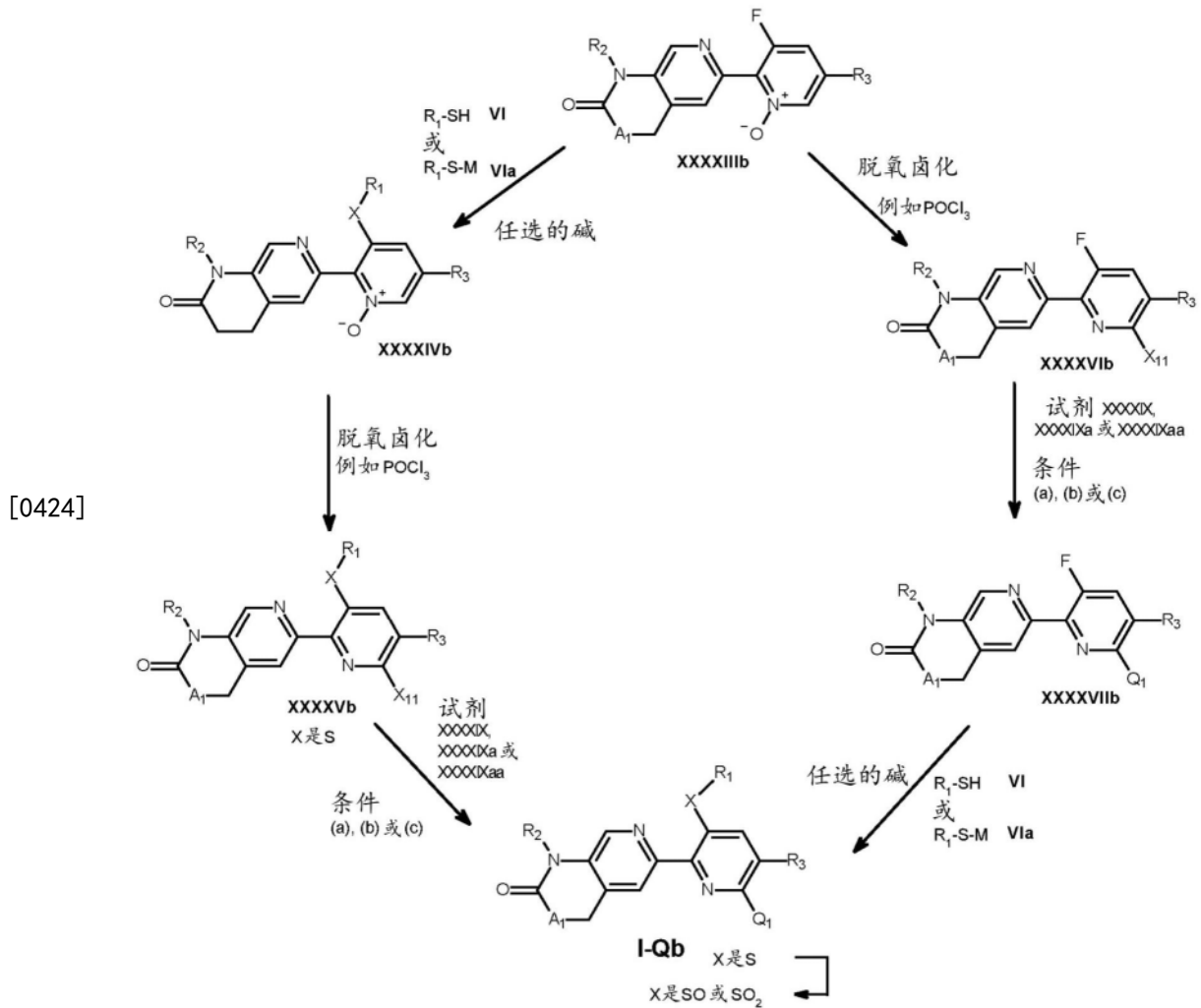
[0419] R_{2a} 是氢或 C_1-C_6 卤代烷基(基团 R_2 如上式I定义的);并且

[0420] X_{10} 是卤素或拟卤素离去基团,如三氟甲磺酸酯,

[0421] 是新颖的,是为了制备根据本发明的具有式I的化合物而特别研发的并且因此表示本发明的另一目的。具有式I的化合物的取代基的优先选项和优选实施例对具有式XXIXa的化合物也是有效的。在本实施例的一方面, R_{2a} 优选地是氢;在本实施例的另一方面, R_{2a} 优选地是 C_1-C_6 卤代烷基(R_2 如上式I定义的)。优选地, X_{10} 是溴或氯;甚至更优选地, X_{10} 是溴。

[0422] 具有式I的化合物的亚组(其中 A_1 和 R_2 如式I中所定义的并且其中Q被定义为Qb,其中 Q_1 、 R_3 、X和 R_1 是如式I中所定义的并且其中 A_2 是N)可以被定义为具有式I-Qb的化合物(方案19)。这样的具有式I-Qb的化合物可以按照方案19制备。在特定情况中,当 Q_1 为经由氮原子连接至含有基团 A_2 的环的任选取代的三唑时,则具有式I-Qb的化合物(其中X是S并且其中 A_1 、 R_1 、 R_2 、 Q_1 和 R_3 是如式I中定义的)

[0423] 方案19



[0425] (a) 铃木反应: Pd催化剂(例如Pd(PPh₃)₄或Pd(dppf)Cl₂)、碱(例如Na₂CO₃)、溶剂(例如1,2-二甲氧基乙烷/水)、25°C-180°C。

[0426] (b) 施蒂勒反应: Pd催化剂(例如Pd(PPh₃)₄或Pd(PPh₃)Cl₂)、溶剂(例如甲苯)、25°C-180°C。

[0427] (c) C-N键形成: 任选的碱(例如K₂CO₃或Cs₂CO₃)、任选存在铜或钯催化剂、任选的添加剂(如N,N'-二甲基乙二胺)、任选的配体(如Xantphos)、溶剂(例如二噁烷、吡啶或N,N-二甲基甲酰胺DMF)、25°C-180°C。

[0428] 试剂: $Yb1-Q1$ XXXXIX (铃木反应) 或 $Yb2-Q1$ XXXXIXa (施蒂勒反应) 或 $Q1-H$ XXXXIXaa (C-N键形成)

[0429] 可以由具有式XXXXVb的化合物(其中X是S并且其中A₁、R₁、R₂和R₃是如式I中定义的,并且其中X₁₁是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯(如三氟甲磺酸酯))通过与任选取代的三唑Q₁-H(其含有适当的NH官能度)(XXXXIXaa)(其中Q₁是N-连接的三唑基),在溶剂(如醇(例如,甲醇、乙醇、异丙醇或较高沸点的直链或支链醇)、吡啶或乙酸)中,任选地在额外的碱(如碳酸钾K₂CO₃或碳酸铯Cs₂CO₃)存在下,任选地在铜催化剂(例如碘化铜(I))存在下,在30°C-180°C之间的温度下,任选地在微波辐射下反应(C-N键形成)来制备(方案19)。

[0430] 在方案19内的特定情况中,当Q₁是-N(R₄)COR₅或-N(R₄)CON(R₄)₂(其中R₄和R₅是如式

I中定义的)时,则具有式I-Qb的化合物(其中X是S)可以由具有式XXXXVb的化合物(其中X是S并且其中 A_1 、 R_1 、 R_2 和 R_3 是如式I中定义的,并且其中 X_{11} 是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯(如三氟甲磺酸酯)),通过与试剂 Q_1 -H(XXXXIXaa)(相当于 $HN(R_4)COR_5$ 或 $HN(R_4)CON(R_4)_2$,其中 R_4 和 R_5 是如式I中定义的)的反应(C-N键形成)来制备。这样的反应是在碱(如碳酸钾、碳酸铯、氢氧化钠)存在下,在惰性溶剂(如甲苯、二甲基甲酰胺DMF、N-甲基吡咯烷NMP、二甲亚砜DMSO、二噁烷、四氢呋喃THF等)中,任选地在催化剂(例如乙酸钯(II)、双(二亚苄基丙酮)钯(0)(Pd(dba)₂)或三(二亚苄基丙酮)二钯(0)(Pd₂(dba)₃),任选地以氯仿加合物的形式)或钯预催化剂(例如像tert-BuBrettPhos Pd G3[(2-二-叔丁基膦基-3,6-二甲氧基-2',4',6'-三异丙基-1,1'-联苯基)-2-(2'-氨基-1,1'-联苯基)]甲磺酸钯(II)或BrettPhos Pd G3[(2-二-环己基膦基-3,6-二甲氧基-2',4',6'-三异丙基-1,1'-联苯基)-2-(2'-氨基-1,1'-联苯基)]甲磺酸钯(II))存在下,并且任选地在配体(例如SPhos、t-BuBrettPhos或Xantphos)存在下,在60°C-120°C之间的温度下,任选地在微波辐射下进行。

[0431] 在方案19内的特定情况中,当 Q_1 是 $-N(R_4)_2$ (其中 R_4 是如式I中定义的)时,则具有式I-Qb的化合物(其中X是S)可以由具有式XXXXVb的化合物(其中X是S并且其中 A_1 、 R_1 、 R_2 和 R_3 是如式I中定义的,并且其中 X_{11} 是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯(如三氟甲磺酸酯)),通过与试剂 Q_1 -H(XXXXIXaa)(相当于 $HN(R_4)_2$,或其盐(如氢卤化物盐,优选盐酸盐或氢溴酸盐、或三氟乙酸盐、或任何其他等效盐,其中 R_4 是如式I中定义的))反应(C-N键形成)来制备。这样的反应通常是在惰性溶剂(如醇、酰胺、酯、醚、腈和水,特别优选的是甲醇、乙醇、2,2,2-三氟乙醇、丙醇、异丙醇、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二噁烷、四氢呋喃、二甲氧基乙烷、乙腈、乙酸乙酯、甲苯、水或其混合物)中,在0°C-150°C之间的温度下,任选地在微波辐射或使用高压釜的加压条件下,任选地在铜催化剂(如铜粉、碘化铜(I)或硫酸铜(任选地以水合物的形式)或其混合物)存在下,任选地在配体(例如二胺配体(例如N,N'-二甲基乙二胺或反式-环己基二胺)或二亚苄基丙酮(dba)或1,10-菲咯啉)存在下,并且任选地在碱(如磷酸钾)存在下进行。

[0432] 试剂 $HN(R_4)_2$ 、 $HN(R_4)COR_5$ 、或 $HN(R_4)CON(R_4)_2$ (其中 R_4 和 R_5 是如式I中定义的)是已知的、可商购的或可以通过本领域技术人员已知的方法制备。

[0433] 可替代地,具有式I-Qb的化合物(其中X是S)可以通过铃木(Suzuki)反应(方案19)来制备,该反应涉及例如使具有式XXXXVb的化合物(其中X是S并且其中 A_1 、 R_1 、 R_2 和 R_3 是如式I中定义的,并且其中 X_{11} 是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯(如三氟甲磺酸酯))与具有式XXXXIX的化合物(其中 Q_1 是如式I中定义的,并且其中 Y_{b1} 可以是硼衍生的官能团,例如像 $B(OH)_2$ 或 $B(OR_{b1})_2$,其中 R_{b1} 可以是 C_1 - C_4 烷基或两个基团 OR_{b1} 可以与硼原子一起形成五元环,像例如频哪醇硼酸酯)反应。该反应可以被钯基催化剂(例如四(三苯基-膦)钯(0)、(1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁)二氯-钯-二氯甲烷(1:1复合物)或氯(2-二环己基膦基-2',4',6'-三异丙基-1,1'-联苯基)[2-(2'-氨基-1,1'-联苯基)]钯(II)(XPhos环钯配合物)),在碱(像碳酸钠、磷酸三钾或氟化铯)存在下,在溶剂或溶剂混合物(像例如二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺、1,2-二甲氧基乙烷和水的混合物或二噁烷/水的混合物、或甲苯/水的混合物)中,优选地在惰性气氛下催化。反应温度可以优先地在从室温至反应混合物的沸点的范围内,或者该反应可以在微波辐射下进行。这样的铃木反应是

本领域技术人员众所周知的,并且已综述于例如J. Orgmet. Chem. [有机金属化学杂志] 576, 1999, 147-168中。

[0434] 可替代地,具有式I-Qb的化合物(其中X是S)可以通过具有式XXXXIXa的化合物(其中 Q_1 是如上定义的,并且其中 Y_{b2} 是三烷基锡衍生物,优选地是三-正丁基锡或三甲基锡)与具有式XXXXVb的化合物(其中X是S并且其中 A_1 、 R_1 、 R_2 和 R_3 是如式I中定义的,并且其中 X_{11} 是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯(如三氟甲磺酸酯))之间的施蒂勒反应来制备。这样的施蒂勒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)二氯化钯(II))存在下,在惰性溶剂(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)存在下,并且任选地在另外的催化剂(例如碘化铜(I))存在下进行。这样的施蒂勒偶联也是本领域技术人员众所周知的,并且已经例如描述于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; 以及Angew. Chem. Int. Ed. [应用化学国际版], 2004, 43, 1132-1136中。

[0435] 当 Q_1 是五元芳香族环体系(经由氮原子连接至含有取代基 A_2 的环)时,则具有式I-Qb的化合物(其中X是S)可以由具有式XXXXVb的化合物(其中X是S并且其中 A_1 、 R_1 、 R_2 和 R_3 是如式I中定义的,并且其中 X_{11} 是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯(如三氟甲磺酸酯)),通过与杂环 Q_1 -H(其包含合适的NH官能度)(XXXXIXaa)(其中 Q_1 如以上定义的),在碱(如碳酸钾 K_2CO_3 或碳酸铯 Cs_2CO_3)存在下,任选地在铜催化剂(例如碘化铜(I))存在下,在具有或不具有添加剂(如L-脯氨酸、N,N'-二甲基环己烷-1,2-二胺或N,N'-二甲基-乙二胺)的情况下,在惰性溶剂(如N-甲基吡咯烷酮NMP或N,N-二甲基甲酰胺DMF)中,在30°C-150°C之间的温度下,任选地在微波辐射下反应来制备。

[0436] 大量具有式(XXXXIX)、(XXXXIXa)和(XXXXIXaa)的化合物是可商购的或可以由本领域技术人员制备。

[0437] 可替代地,具有式I-Qb的化合物(其中X是SO或SO₂)可以由具有式XXXXVb的化合物(其中X是SO或SO₂并且其中 A_1 、 R_1 、 R_2 和 R_3 是如式I中定义的,并且其中 X_{11} 是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯(如三氟甲磺酸酯)),通过涉及与以上所述相同的化学过程但是通过改变步骤的顺序(即,通过对XXXXVb(其中X是S)运行氧化步骤以形成XXXXVb(其中X是SO或SO₂),然后是序列XXXXVb(X是SO或SO₂)至I-Qb(X是SO或SO₂)(经由铃木、施蒂勒或C-N键形成))制备。

[0438] 将具有式XXXXVb的化合物(其中X是S并且其中 A_1 、 R_1 、 R_2 、和 R_3 是如式I中定义的,并且其中 X_{11} 是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯(如三氟甲磺酸酯))用合适的氧化剂氧化成具有式XXXXVb的化合物(其中X是SO或SO₂)可以在上文已描述的条件实现。

[0439] 具有式XXXXVb的化合物(其中X是S并且其中 A_1 、 R_1 、 R_2 和 R_3 是如式I中定义的,并且其中 X_{11} 是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯(如三氟甲磺酸酯))可以通过使具有式XXXXIVb的化合物(其中X是S并且其中 A_1 、 R_1 、 R_2 、和 R_3 是如式I中定义的)与卤化剂(如三氯氧化磷POCl₃或三溴氧化磷,纯的或在合适的溶剂如氯仿或甲苯中),任选地在碱(如三乙胺或吡啶)存在下,在室温与回流条件之间的温度下进行反应来制备(方案19)。这样的脱氧卤化已经描述于例如WO 16/116338中。

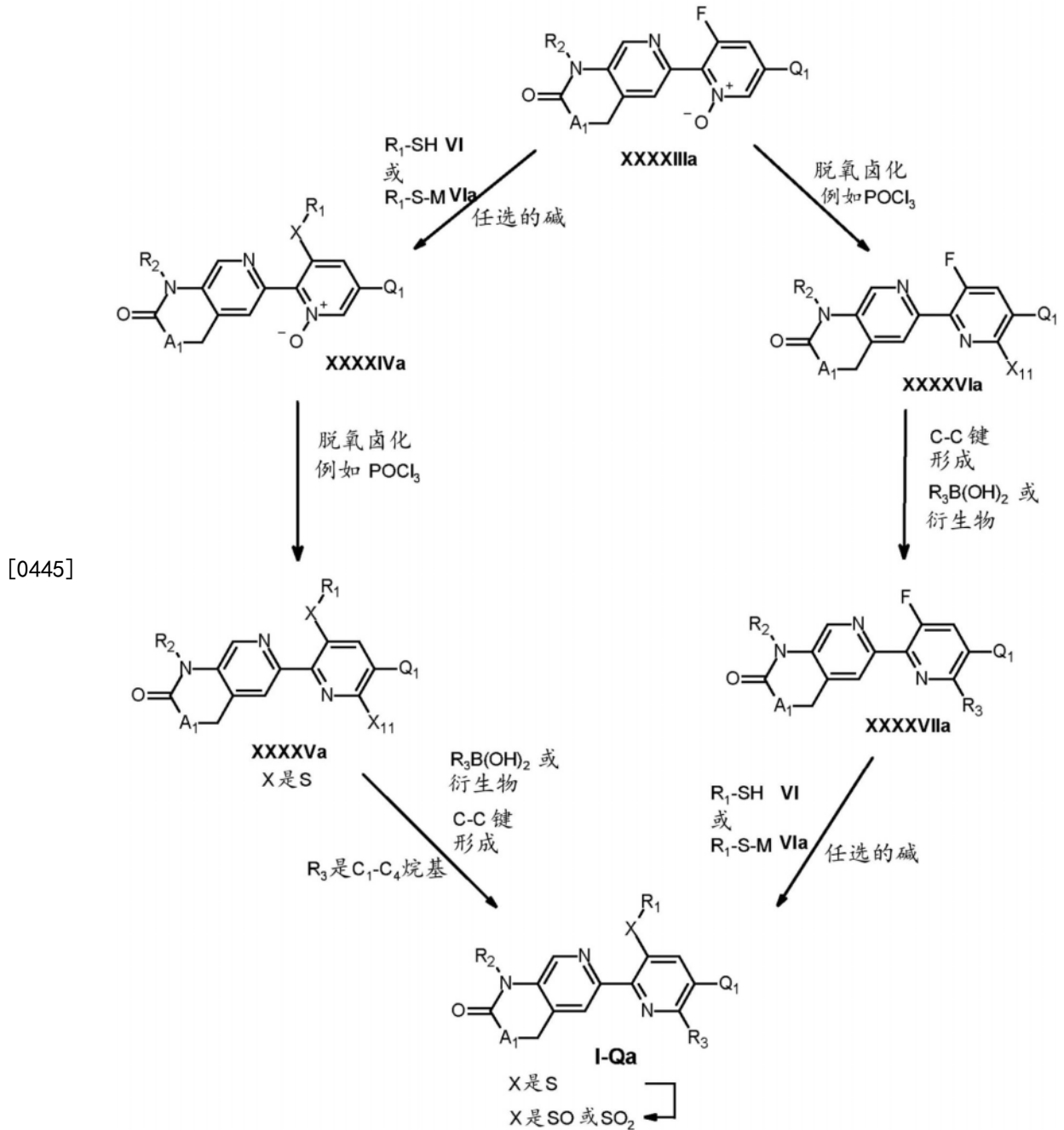
[0440] 具有式XXXXIVb的化合物(其中X是S并且其中 A_1 、 R_1 、 R_2 和 R_3 是如式I中定义的)可以通过使具有式XXXXIIIb的化合物(其中 A_1 、 R_2 和 R_3 是如式I中定义的)与具有式VI或VIa的试剂(其中 R_1 是如式I中定义的)在上文已描述的条件下(参见文本方案3)反应来制备。

[0441] 可替代地,具有式I-Qb的化合物(其中X是S、SO或SO₂)可以由具有式XXXXIIIb的化合物通过涉及与上文描述的相同的化学过程,但通过改变这些步骤的顺序(即,通过运行序列XXXXIIIb至XXXXVIb,XXXXVIb至XXXXVIIb(先前描述的)、以及XXXXVIIb至I-Qb,然后氧化)制备(方案19),并且其中先前提到的所有取代基定义仍然有效。

[0442] 具有式XXXXIIIb的化合物(其中 A_1 、 R_2 和 R_3 是如式I中定义的)可以分别由具有式XIIIb、XIVb的化合物(其中 Q_1 是氢并且 R_3 是如式I中定义的),通过按照类似于方案8和方案17中描述的那些程序的程序来制备。

[0443] 具有式I的化合物的亚组(其中 A_1 和 R_2 如式I中所定义的并且其中Q被定义为Qa,其中 Q_1 、 R_3 、X和 R_1 是如式I中所定义的并且其中 A_2 是N)可以被定义为具有式I-Qa的化合物(方案20)。这样的具有式I-Qa的化合物可以按照方案20制备。在特定情况中,当 R_3 是C₁-C₄烷基时,则具有式I-Qa的化合物(其中X是S并且其中 A_1 、 R_1 、 R_2 、 Q_1 和 R_3 是如式I中定义的)

[0444] 方案20



[0446] 可以由具有式XXXXVa的化合物(其中X是S并且其中 A_1 、 R_1 、 Q_1 和 R_2 是如式I中定义的,并且其中 X_{11} 是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯(如三氟甲磺酸酯)),通过典型地在钯催化的(可替代地镍催化的)交叉偶联条件下的C-C键形成反应来制备(方案20)。具有式XXXXVa的化合物与具有式 $R_3B(OH)_2$ 的 C_1-C_4 烷基硼酸(其中 R_3 是 C_1-C_4 烷基)或对应的 C_1-C_4 烷基硼酸酯衍生物或对应的具有式 $(R_3BO)_3$ 的6元三(C_1-C_4 烷基)硼氧六环衍生物(其中 R_3 是 C_1-C_4 烷基)之间的这样的铃木-宫浦(Suzuki-Miyaura)交叉偶联反应是本领域技术人员众所周知的。在其中 R_3 是甲基的特定情况中,具有式XXXXVa的化合物可以例如与三甲基硼氧六环(也称为2,4,6-三甲基-1,3,5,2,4,6-三氧杂三硼杂环己烷)在钯催化剂(如四(三苯基膦)钯(0)或[1,1'-双(二苯基膦)二茂铁]二氯化钯(II)二氯甲烷络合物)和碱(如碳酸钠或碳酸钾)存在下,在溶剂如N,N-二甲基甲酰胺、二噁烷或二噁烷-水混合物中,在室温与160°C之间的温度下,任选在微波加热条件下,并且优选

在惰性气氛下进行反应。这样的条件描述于例如Tetrahedron Letters [四面体快报] (2000), 41 (32), 6237-6240中。

[0447] 具有式XXXXVa的化合物(其中X是S并且其中 A_1 、 R_1 、 R_2 和 Q_1 是如式I中定义的,并且其中 X_{11} 是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯(如三氟甲磺酸酯))可以由具有式XXXXIIIa的化合物(经由具有式XXXXIVa的化合物)(其中 Q_1 是如式I中定义的),按上文已描述的序列和条件(参见文本方案19)来制备,并且其中先前提到的所有取代基定义仍然有效。

[0448] 可替代地,具有式I-Qa的化合物(其中X是S0或 SO_2)可以由具有式XXXXVa的化合物(其中X是S0或 SO_2 并且其中 A_1 、 R_1 、 R_2 和 Q_1 是如式I中定义的,并且其中 X_{11} 是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯(如三氟甲磺酸酯)),通过涉及与以上所述相同的化学过程但是通过改变步骤的顺序(即,通过对XXXXVa(其中X是S)运行氧化步骤以形成XXXXVa(其中X是S0或 SO_2),然后是序列XXXXVa(X是S0或 SO_2)至I-Qa(X是S0或 SO_2)(经由与 $R_3B(OH)_2$ 或等效物的C-C键形成))制备。

[0449] 将具有式XXXXVa的化合物(其中X是S并且其中 A_1 、 R_1 、 R_2 和 Q_1 是如式I中定义的,并且其中 X_{11} 是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯(如三氟甲磺酸酯))用合适的氧化剂氧化成具有式XXXXVa的化合物(其中X是S0或 SO_2)可以在上文已描述的条件实现。

[0450] 可替代地,具有式I-Qa的化合物(其中X是S、S0或 SO_2)可以由具有式XXXXIIIa的化合物通过涉及与上文刚描述的相同的化学过程,但通过改变这些步骤的顺序(即,通过运行序列XXXXIIIa至XXXXVIa、XXXXVIa至XXXXVIIa(先前描述的)、以及XXXXVIIa至I-Qa,然后氧化)来制备(方案20),并且其中先前提到的所有取代基定义仍然有效。

[0451] 在特定情况中,当 R_3 是氢时,则具有式I-Qa的化合物(其中X是S、S0或 SO_2 ,并且其中 A_1 、 R_1 、 R_2 和 Q_1 是如式I中定义的)可以可替代地由具有式XXXXVa的化合物(其中X是S、S0或 SO_2 并且其中 A_1 、 R_1 、 R_2 和 Q_1 是如式I中定义的,并且其中 X_{11} 是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯(如三氟甲磺酸酯))通过还原脱卤制备(方案20)。这样的加氢脱卤可以例如使用锌粉和乙酸或三氟乙酸或其混合物在0°C与120°C之间、优选在50°C与回流温度之间的温度下实现,如例如在Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 1: Organic and Bio-Organic Chemistry [英国化学会志, 普尔金会报1: 有机和生物有机化学] (1972-1999), (10), 2501-6, 1983或US 20100076027中所述。

[0452] 具有式 $R_3B(OH)_2$ 的 C_1 - C_4 烷基硼酸(其中 R_3 是 C_1 - C_4 烷基)或对应的 C_1 - C_4 烷基硼酸酯衍生物或对应的具有式 $(R_3BO)_3$ 的6元三(C_1 - C_4 烷基)硼氧六环衍生物(其中 R_3 是 C_1 - C_4 烷基)是已知的、可商购的或可以通过本领域技术人员已知的方法制备。

[0453] 具有式XXXXIIIa的化合物(其中 A_1 、 R_2 和 Q_1 是如式I中定义的)可以分别由具有式XIIIa、XIVa的化合物(其中 Q_1 是如式I中定义的并且其中 R_3 是氢),通过按照类似于方案7和方案16中描述的那些程序的程序来制备。

[0454] 反应物可以在碱存在下反应。适合的碱的实例是碱金属或碱土金属氢氧化物、碱金属或碱土金属氢化物、碱金属或碱土金属酰胺、碱金属或碱土金属醇盐、碱金属或碱土金属乙酸盐、碱金属或碱土金属碳酸盐、碱金属或碱土金属二烷基酰胺或碱金属或碱土金属烷基甲硅烷基酰胺、烷基胺、亚烷基二胺、游离的或N-烷基化的饱和或不饱和的环烷基胺、

碱性杂环、氢氧化铵以及碳环胺。可以提及的实例是氢氧化钠、氢化钠、氨基钠、甲醇钠、乙酸钠、碳酸钠、叔丁醇钾、氢氧化钾、碳酸钾、氢化钾、二异丙氨基锂、双(三甲基甲硅烷基)酰胺钾、氯化钙、三乙胺、二异丙基乙胺、三亚乙基二胺、环己胺、N-环己基-N,N-二甲胺、N,N-二乙基苯胺、吡啶、4-(N,N-二甲基氨基)吡啶、奎宁环、N-甲基吗啉、苄基三甲基铵氢氧化物以及1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯(DBU)。

[0455] 这些反应物可以按照原样彼此进行反应,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的混合物是有利的。如果该反应在碱存在下进行,那么这些过量使用的碱(如三乙胺、吡啶、N-甲基吗啉或N,N-二乙基苯胺)还可以充当溶剂或稀释剂。

[0456] 这些反应有利地在从约-80°C到约+140°C、优选从约-30°C到约+100°C的温度范围内,在许多情况下在环境温度与约+80°C之间的范围内进行。

[0457] 通过以常规方式用根据本发明的(另一个)其他取代基替代具有式I的起始化合物的一个或多个取代基,并通过用本领域技术人员已知的反应(如氧化、烷基化、还原、酰化和其他方法)对化合物进行后修饰,可以将具有式I的化合物以本身已知的方式转化成另一种具有式I的化合物。

[0458] 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根据本发明的其他取代基来替代。

[0459] 具有式I的化合物的盐可以以本身已知的方式来制备。因此,例如,具有式I的化合物的酸加成盐是通过用适合的酸或适合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适合的碱或用适合的离子交换剂试剂进行处理来获得的。

[0460] 具有式I的化合物的盐可以以常规方式转化为游离的化合物I、酸加成盐(例如通过用适合的碱性化合物或用适合的离子交换剂试剂进行处理)以及与碱的盐(例如通过用适合的酸或用适合的离子交换剂试剂进行处理)。

[0461] 具有式I的化合物的盐可以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,例如通过在适合的溶剂中用酸的适合的金属盐(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。

[0462] 取决于程序或反应条件,具有成盐特性的具有式I的化合物可以以游离形式或盐的形式获得。

[0463] 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,即使立体化学细节未在每种情况下明确提及。

[0464] 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(它们可以取决于已选定的起始材料和程序而获得)可以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。

[0465] 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,从该非对映异构体可以通过适合的试剂(例如碱性试剂)的作用使所希望的对映异构体变成游离的。

[0466] 纯的非对映异构体或对映异构体可根据本发明来获得,不仅是通过分离适合的异构体混合物,还可以是通过普遍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。

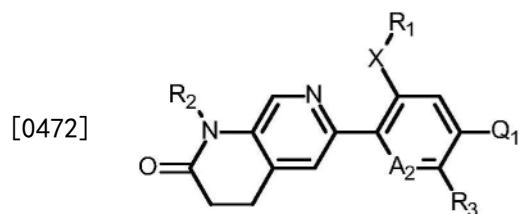
[0467] 可以通过使具有式I的化合物与适合的氧化剂(例如 H_2O_2 /尿素加合物)在酸酐(例如三氟乙酸酐)存在下进行反应来制备N-氧化物。这样的氧化从文献中,例如从J. Med. Chem. [药物化学杂志], 32(12), 2561-73, 1989或W0 2000/15615中是已知的。

[0468] 如果单个组分具有不同的生物活性,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。

[0469] 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)还可以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。

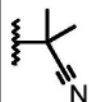

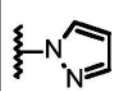
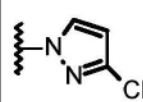
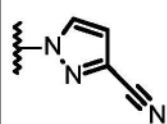
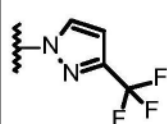
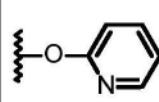

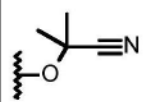
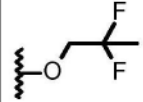

[0470] 根据下表A-1至A-60、表B-1至B-60、表C-1至C-60和表D-1至D-60的化合物可以根据上述方法制备。以下实例旨在说明本发明并且示出优选的具有式I的化合物。

[0471] 下表A-1至A-60说明了本发明的特定化合物。



(I-Qa-1)

[0473] 表Y:Q₁的取代基定义:

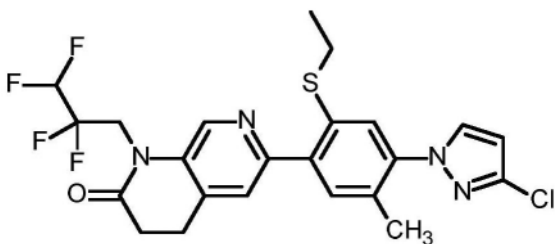
索引	Q ₁	索引	Q ₁
1	H	13	
2	-N(CH ₃)COCH ₂ CH ₃	14	
3	Cl	15	-OCH ₂ CF ₃
4	Br	16	
5	-N(CH ₃)CO 环 C3	17	
[0474] 6	CF ₃	18	
7	-NH ₂	19	
8	-NH(CH ₃)	20	
9	-N(CH ₃) ₂	21	
10	-NHCOCH ₃	22	
11	-N(CH ₃)COCH ₃	23	
12			

[0475] 在表Y和表A中，“环C3”表示环丙基。

[0476] 表A-1提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-1.001至A-1.023，其中R₂是CH₂CF₂CF₃，A₂是N，R₃是H，X是S，R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。

[0477] 例如，化合物A-22.017是

[0478]



[0479] 表A-2提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-2.001至A-2.023,其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是H,X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0480] 表A-3提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-3.001至A-3.023,其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是H,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0481] 表A-4提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-4.001至A-4.023,其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是Me,X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0482] 表A-5提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-5.001至A-5.023,其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是Me,X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0483] 表A-6提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-6.001至A-6.023,其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是Me,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0484] 表A-7提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-7.001至A-7.023,其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是H,X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0485] 表A-8提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-8.001至A-8.023,其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是H,X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0486] 表A-9提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-9.001至A-9.023,其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是H,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0487] 表A-10提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-10.001至A-10.023,其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是Me,X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0488] 表A-11提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-11.001至A-11.023,其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是Me,X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0489] 表A-12提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-12.001至A-12.023,其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是Me,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0490] 表A-13提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-13.001至A-13.023,其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是N, R_3 是H,X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0491] 表A-14提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-14.001至A-14.023,其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是N, R_3 是H,X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0492] 表A-15提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-15.001至A-15.023,其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是N, R_3 是H,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0493] 表A-16提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-16.001至A-16.023,其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是N, R_3 是Me,X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0494] 表A-17提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-17.001至A-17.023,其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是N, R_3 是Me,X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0495] 表A-18提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-18.001至A-18.023,其中 R_2 是

$\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是N, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0496] 表A-19提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-19.001至A-19.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是CH, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0497] 表A-20提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-20.001至A-20.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是CH, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0498] 表A-21提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-21.001至A-21.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是CH, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0499] 表A-22提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-22.001至A-22.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0500] 表A-23提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-23.001至A-23.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0501] 表A-24提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-24.001至A-24.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0502] 表A-25提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-25.001至A-25.023, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0503] 表A-26提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-26.001至A-26.023, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0504] 表A-27提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-27.001至A-27.023, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0505] 表A-28提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-28.001至A-28.023, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0506] 表A-29提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-29.001至A-29.023, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0507] 表A-30提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-30.001至A-30.023, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0508] 表A-31提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-31.001至A-31.023, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0509] 表A-32提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-32.001至A-32.023, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0510] 表A-33提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-33.001至A-33.023, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0511] 表A-34提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-34.001至A-34.023, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0512] 表A-35提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-35.001至A-35.023, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0513] 表A-36提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-36.001至A-36.023, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0514] 表A-37提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-37.001至A-37.023, 其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

- [0515] 表A-38提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-38.001至A-38.023,其中R₂是CH₂CHF₂,A₂是N,R₃是H,X是SO,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0516] 表A-39提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-39.001至A-39.023,其中R₂是CH₂CHF₂,A₂是N,R₃是H,X是SO₂,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0517] 表A-40提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-40.001至A-40.023,其中R₂是CH₂CHF₂,A₂是N,R₃是Me,X是S,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0518] 表A-41提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-41.001至A-41.023,其中R₂是CH₂CHF₂,A₂是N,R₃是Me,X是SO,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0519] 表A-42提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-42.001至A-42.023,其中R₂是CH₂CHF₂,A₂是N,R₃是Me,X是SO₂,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0520] 表A-43提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-43.001至A-43.023,其中R₂是CH₂CHF₂,A₂是CH,R₃是H,X是S,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0521] 表A-44提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-44.001至A-44.023,其中R₂是CH₂CHF₂,A₂是CH,R₃是H,X是SO,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0522] 表A-45提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-45.001至A-45.023,其中R₂是CH₂CHF₂,A₂是CH,R₃是H,X是SO₂,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0523] 表A-46提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-46.001至A-46.023,其中R₂是CH₂CHF₂,A₂是CH,R₃是Me,X是S,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0524] 表A-47提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-47.001至A-47.023,其中R₂是CH₂CHF₂,A₂是CH,R₃是Me,X是SO,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0525] 表A-48提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-48.001至A-48.023,其中R₂是CH₂CHF₂,A₂是CH,R₃是Me,X是SO₂,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0526] 表A-49提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-49.001至A-49.023,其中R₂是CH₂CF₂CHF₂CF₃,A₂是N,R₃是H,X是S,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0527] 表A-50提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-50.001至A-50.023,其中R₂是CH₂CF₂CHF₂CF₃,A₂是N,R₃是H,X是SO,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0528] 表A-51提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-51.001至A-51.023,其中R₂是CH₂CF₂CHF₂CF₃,A₂是N,R₃是H,X是SO₂,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0529] 表A-52提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-52.001至A-52.023,其中R₂是CH₂CF₂CHF₂CF₃,A₂是N,R₃是Me,X是S,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0530] 表A-53提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-53.001至A-53.023,其中R₂是CH₂CF₂CHF₂CF₃,A₂是N,R₃是Me,X是SO,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0531] 表A-54提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-54.001至A-54.023,其中R₂是CH₂CF₂CHF₂CF₃,A₂是N,R₃是Me,X是SO₂,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0532] 表A-55提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-55.001至A-55.023,其中R₂是CH₂CF₂CHF₂CF₃,A₂是CH,R₃是H,X是S,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0533] 表A-56提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-56.001至A-56.023,其中R₂是CH₂CF₂CHF₂CF₃,A₂是CH,R₃是H,X是SO,R₁是乙基并且Q₁是如表Y中所定义的。
- [0534] 表A-57提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-57.001至A-57.023,其中R₂是

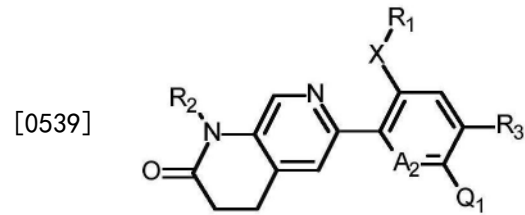
$\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0535] 表A-58提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-58.001至A-58.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0536] 表A-59提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-59.001至A-59.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是 SO , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0537] 表A-60提供了具有式I-Qa-1的23种化合物A-60.001至A-60.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0538] 以下表B-1至B-60说明了本发明的另外的特定化合物。

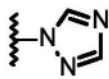
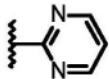
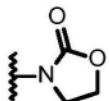


(I-Qb-1)

[0540] 表Z: Q_1 的取代基定义:

索引	Q_1	索引	Q_1
1	H	12	
2	Cl	13	-N(H)CONH ₂
3	Br	14	-N(H)CONH(CH ₃)
4	-N(CH ₃)COCH ₂ CH ₃	15	-N(H)CON(CH ₃) ₂
5	-NH ₂	16	-N(CH ₃)CONH ₂
6	-NH(CH ₃)	17	-N(CH ₃)CONH(CH ₃)
7	-N(CH ₃) ₂	18	-N(CH ₃)CON(CH ₃) ₂

[0541]

索引	Q ₁	索引	Q ₁
8	-NHCOCH ₃	19	
[0542] 9	-N(CH ₃)COCH ₃	20	
10	-NHCO 环 C3	21	
11	-N(CH ₃)CO 环 C3		

[0543] 在表Z和表B中，“环C3”表示环丙基。

[0544] 表B-1提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-1.001至B-1.021，其中R₂是CH₂CF₂CF₃，A₂是N，R₃是H，X是S，R₁是乙基并且Q₁是如表Z中定义的。

[0545] 表B-2提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-2.001至B-2.021，其中R₂是CH₂CF₂CF₃，A₂是N，R₃是H，X是SO，R₁是乙基并且Q₁是如表Z中定义的。

[0546] 表B-3提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-3.001至B-3.021，其中R₂是CH₂CF₂CF₃，A₂是N，R₃是H，X是SO₂，R₁是乙基并且Q₁是如表Z中定义的。

[0547] 表B-4提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-4.001至B-4.021，其中R₂是CH₂CF₂CF₃，A₂是N，R₃是Me，X是S，R₁是乙基并且Q₁是如表Z中定义的。

[0548] 表B-5提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-5.001至B-5.021，其中R₂是CH₂CF₂CF₃，A₂是N，R₃是Me，X是SO，R₁是乙基并且Q₁是如表Z中定义的。

[0549] 表B-6提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-6.001至B-6.021，其中R₂是CH₂CF₂CF₃，A₂是N，R₃是Me，X是SO₂，R₁是乙基并且Q₁是如表Z中定义的。

[0550] 表B-7提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-7.001至B-7.021，其中R₂是CH₂CF₂CF₃，A₂是CH，R₃是H，X是S，R₁是乙基并且Q₁是如表Z中定义的。

[0551] 表B-8提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-8.001至B-8.021，其中R₂是CH₂CF₂CF₃，A₂是CH，R₃是H，X是SO，R₁是乙基并且Q₁是如表Z中定义的。

[0552] 表B-9提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-9.001至B-9.021，其中R₂是CH₂CF₂CF₃，A₂是CH，R₃是H，X是SO₂，R₁是乙基并且Q₁是如表Z中定义的。

[0553] 表B-10提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-10.001至B-10.021，其中R₂是CH₂CF₂CF₃，A₂是CH，R₃是Me，X是S，R₁是乙基并且Q₁是如表Z中定义的。

[0554] 表B-11提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-11.001至B-11.021，其中R₂是CH₂CF₂CF₃，A₂是CH，R₃是Me，X是SO，R₁是乙基并且Q₁是如表Z中定义的。

[0555] 表B-12提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-12.001至B-12.021，其中R₂是CH₂CF₂CF₃，A₂是CH，R₃是Me，X是SO₂，R₁是乙基并且Q₁是如表Z中定义的。

[0556] 表B-13提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-13.001至B-13.021，其中R₂是

$\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是N, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0557] 表B-14提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-14.001至B-14.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是N, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0558] 表B-15提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-15.001至B-15.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是N, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0559] 表B-16提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-16.001至B-16.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是N, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0560] 表B-17提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-17.001至B-17.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是N, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0561] 表B-18提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-18.001至B-18.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是N, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0562] 表B-19提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-19.001至B-19.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是CH, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0563] 表B-20提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-20.001至B-20.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是CH, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0564] 表B-21提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-21.001至B-21.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是CH, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0565] 表B-22提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-22.001至B-22.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0566] 表B-23提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-23.001至B-23.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0567] 表B-24提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-24.001至B-24.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0568] 表B-25提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-25.001至B-25.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0569] 表B-26提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-26.001至B-26.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0570] 表B-27提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-27.001至B-27.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0571] 表B-28提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-28.001至B-28.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0572] 表B-29提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-29.001至B-29.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0573] 表B-30提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-30.001至B-30.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0574] 表B-31提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-31.001至B-31.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0575] 表B-32提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-32.001至B-32.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

- [0576] 表B-33提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-33.001至B-33.021,其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是H,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0577] 表B-34提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-34.001至B-34.021,其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是Me,X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0578] 表B-35提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-35.001至B-35.021,其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是Me,X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0579] 表B-36提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-36.001至B-36.021,其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是Me,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0580] 表B-37提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-37.001至B-37.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是H,X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0581] 表B-38提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-38.001至B-38.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是H,X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0582] 表B-39提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-39.001至B-39.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是H,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0583] 表B-40提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-40.001至B-40.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是Me,X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0584] 表B-41提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-41.001至B-41.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是Me,X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0585] 表B-42提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-42.001至B-42.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是Me,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0586] 表B-43提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-43.001至B-43.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是CH, R_3 是H,X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0587] 表B-44提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-44.001至B-44.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是CH, R_3 是H,X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0588] 表B-45提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-45.001至B-45.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是CH, R_3 是H,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0589] 表B-46提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-46.001至B-46.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是CH, R_3 是Me,X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0590] 表B-47提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-47.001至B-47.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是CH, R_3 是Me,X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0591] 表B-48提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-48.001至B-48.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是CH, R_3 是Me,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0592] 表B-49提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-49.001至B-49.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2CF_3$, A_2 是N, R_3 是H,X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0593] 表B-50提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-50.001至B-50.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2CF_3$, A_2 是N, R_3 是H,X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0594] 表B-51提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-51.001至B-51.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2CF_3$, A_2 是N, R_3 是H,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0595] 表B-52提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-52.001至B-52.021,其中 R_2 是

$\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0596] 表B-53提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-53.001至B-53.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0597] 表B-54提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-54.001至B-54.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0598] 表B-55提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-55.001至B-55.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0599] 表B-56提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-56.001至B-56.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

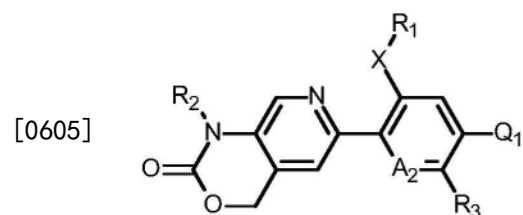
[0600] 表B-57提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-57.001至B-57.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0601] 表B-58提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-58.001至B-58.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0602] 表B-59提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-59.001至B-59.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0603] 表B-60提供了具有式I-Qb-1的21种化合物B-60.001至B-60.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0604] 以下表C-1至C-60说明了本发明的另外的特定化合物。



(I-Qa-2)

[0606] 在表Y和表C中, “环C3”表示环丙基。

[0607] 表C-1提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-1.001至C-1.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0608] 表C-2提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-2.001至C-2.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0609] 表C-3提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-3.001至C-3.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0610] 表C-4提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-4.001至C-4.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0611] 表C-5提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-5.001至C-5.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0612] 表C-6提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-6.001至C-6.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0613] 表C-7提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-7.001至C-7.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0614] 表C-8提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-8.001至C-8.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$,

A_2 是CH, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0615] 表C-9提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-9.001至C-9.023, 其中 R_2 是 $CH_2CF_2CF_3$, A_2 是CH, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0616] 表C-10提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-10.001至C-10.023, 其中 R_2 是 $CH_2CF_2CF_3$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0617] 表C-11提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-11.001至C-11.023, 其中 R_2 是 $CH_2CF_2CF_3$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是 SO , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0618] 表C-12提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-12.001至C-12.023, 其中 R_2 是 $CH_2CF_2CF_3$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0619] 表C-13提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-13.001至C-13.023, 其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是N, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0620] 表C-14提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-14.001至C-14.023, 其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是N, R_3 是H, X是 SO , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0621] 表C-15提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-15.001至C-15.023, 其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是N, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0622] 表C-16提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-16.001至C-16.023, 其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是N, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0623] 表C-17提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-17.001至C-17.023, 其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是N, R_3 是Me, X是 SO , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0624] 表C-18提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-18.001至C-18.023, 其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是N, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0625] 表C-19提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-19.001至C-19.023, 其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是CH, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0626] 表C-20提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-20.001至C-20.023, 其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是CH, R_3 是H, X是 SO , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0627] 表C-21提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-21.001至C-21.023, 其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是CH, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0628] 表C-22提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-22.001至C-22.023, 其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0629] 表C-23提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-23.001至C-23.023, 其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是 SO , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0630] 表C-24提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-24.001至C-24.023, 其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0631] 表C-25提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-25.001至C-25.023, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0632] 表C-26提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-26.001至C-26.023, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是H, X是 SO , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0633] 表C-27提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-27.001至C-27.023, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

- [0634] 表C-28提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-28.001至C-28.023,其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0635] 表C-29提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-29.001至C-29.023,其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0636] 表C-30提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-30.001至C-30.023,其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0637] 表C-31提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-31.001至C-31.023,其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0638] 表C-32提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-32.001至C-32.023,其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0639] 表C-33提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-33.001至C-33.023,其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0640] 表C-34提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-34.001至C-34.023,其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0641] 表C-35提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-35.001至C-35.023,其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0642] 表C-36提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-36.001至C-36.023,其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0643] 表C-37提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-37.001至C-37.023,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0644] 表C-38提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-38.001至C-38.023,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0645] 表C-39提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-39.001至C-39.023,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0646] 表C-40提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-40.001至C-40.023,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0647] 表C-41提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-41.001至C-41.023,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0648] 表C-42提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-42.001至C-42.023,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0649] 表C-43提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-43.001至C-43.023,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是CH, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0650] 表C-44提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-44.001至C-44.023,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是CH, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0651] 表C-45提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-45.001至C-45.023,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是CH, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0652] 表C-46提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-46.001至C-46.023,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是CH, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。
- [0653] 表C-47提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-47.001至C-47.023,其中 R_2 是

CH_2CHF_2 , A_2 是CH, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0654] 表C-48提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-48.001至C-48.023, 其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是CH, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0655] 表C-49提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-49.001至C-49.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0656] 表C-50提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-50.001至C-50.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0657] 表C-51提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-51.001至C-51.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0658] 表C-52提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-52.001至C-52.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0659] 表C-53提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-53.001至C-53.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0660] 表C-54提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-54.001至C-54.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0661] 表C-55提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-55.001至C-55.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0662] 表C-56提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-56.001至C-56.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

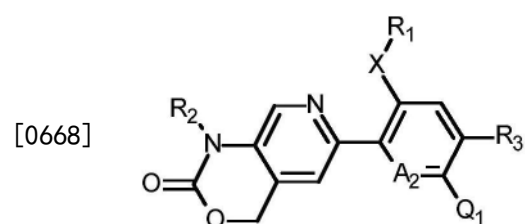
[0663] 表C-57提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-57.001至C-57.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0664] 表C-58提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-58.001至C-58.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0665] 表C-59提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-59.001至C-59.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0666] 表C-60提供了具有式I-Qa-2的23种化合物C-60.001至C-60.023, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}\text{CF}_3$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Y中所定义的。

[0667] 下表D-1至D-60展示了本发明的另外的特定化合物。



(I-Qb-2)

[0669] 在表Z和表D中, “环C3”表示环丙基。

[0670] 表D-1提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-1.001至D-1.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0671] 表D-2提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-2.001至D-2.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, A_2 是N, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

- [0672] 表D-3提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-3.001至D-3.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CF_3$, A_2 是N, R_3 是H,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0673] 表D-4提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-4.001至D-4.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CF_3$, A_2 是N, R_3 是Me,X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0674] 表D-5提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-5.001至D-5.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CF_3$, A_2 是N, R_3 是Me,X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0675] 表D-6提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-6.001至D-6.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CF_3$, A_2 是N, R_3 是Me,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0676] 表D-7提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-7.001至D-7.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CF_3$, A_2 是CH, R_3 是H,X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0677] 表D-8提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-8.001至D-8.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CF_3$, A_2 是CH, R_3 是H,X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0678] 表D-9提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-9.001至D-9.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CF_3$, A_2 是CH, R_3 是H,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0679] 表D-10提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-10.001至D-10.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CF_3$, A_2 是CH, R_3 是Me,X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0680] 表D-11提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-11.001至D-11.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CF_3$, A_2 是CH, R_3 是Me,X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0681] 表D-12提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-12.001至D-12.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CF_3$, A_2 是CH, R_3 是Me,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0682] 表D-13提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-13.001至D-13.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是N, R_3 是H,X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0683] 表D-14提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-14.001至D-14.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是N, R_3 是H,X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0684] 表D-15提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-15.001至D-15.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是N, R_3 是H,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0685] 表D-16提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-16.001至D-16.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是N, R_3 是Me,X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0686] 表D-17提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-17.001至D-17.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是N, R_3 是Me,X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0687] 表D-18提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-18.001至D-18.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是N, R_3 是Me,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0688] 表D-19提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-19.001至D-19.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是CH, R_3 是H,X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0689] 表D-20提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-20.001至D-20.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是CH, R_3 是H,X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0690] 表D-21提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-21.001至D-21.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHF_2$, A_2 是CH, R_3 是H,X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0691] 表D-22提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-22.001至D-22.021,其中 R_2 是

$\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0692] 表D-23提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-23.001至D-23.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0693] 表D-24提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-24.001至D-24.021, 其中 R_2 是 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$, A_2 是CH, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0694] 表D-25提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-25.001至D-25.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0695] 表D-26提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-26.001至D-26.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0696] 表D-27提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-27.001至D-27.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0697] 表D-28提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-28.001至D-28.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0698] 表D-29提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-29.001至D-29.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0699] 表D-30提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-30.001至D-30.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是N, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0700] 表D-31提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-31.001至D-31.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0701] 表D-32提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-32.001至D-32.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0702] 表D-33提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-33.001至D-33.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0703] 表D-34提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-34.001至D-34.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0704] 表D-35提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-35.001至D-35.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0705] 表D-36提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-36.001至D-36.021, 其中 R_2 是 CH_2CF_3 , A_2 是CH, R_3 是Me, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0706] 表D-37提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-37.001至D-37.021, 其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是H, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0707] 表D-38提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-38.001至D-38.021, 其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是H, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0708] 表D-39提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-39.001至D-39.021, 其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是H, X是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0709] 表D-40提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-40.001至D-40.021, 其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是Me, X是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

[0710] 表D-41提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-41.001至D-41.021, 其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是Me, X是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。

- [0711] 表D-42提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-42.001至D-42.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是N, R_3 是Me, X 是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0712] 表D-43提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-43.001至D-43.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是CH, R_3 是H, X 是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0713] 表D-44提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-44.001至D-44.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是CH, R_3 是H, X 是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0714] 表D-45提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-45.001至D-45.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是CH, R_3 是H, X 是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0715] 表D-46提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-46.001至D-46.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是CH, R_3 是Me, X 是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0716] 表D-47提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-47.001至D-47.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是CH, R_3 是Me, X 是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0717] 表D-48提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-48.001至D-48.021,其中 R_2 是 CH_2CHF_2 , A_2 是CH, R_3 是Me, X 是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0718] 表D-49提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-49.001至D-49.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHFCF_3$, A_2 是N, R_3 是H, X 是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0719] 表D-50提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-50.001至D-50.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHFCF_3$, A_2 是N, R_3 是H, X 是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0720] 表D-51提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-51.001至D-51.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHFCF_3$, A_2 是N, R_3 是H, X 是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0721] 表D-52提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-52.001至D-52.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHFCF_3$, A_2 是N, R_3 是Me, X 是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0722] 表D-53提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-53.001至D-53.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHFCF_3$, A_2 是N, R_3 是Me, X 是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0723] 表D-54提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-54.001至D-54.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHFCF_3$, A_2 是N, R_3 是Me, X 是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0724] 表D-55提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-55.001至D-55.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHFCF_3$, A_2 是CH, R_3 是H, X 是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0725] 表D-56提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-56.001至D-56.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHFCF_3$, A_2 是CH, R_3 是H, X 是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0726] 表D-57提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-57.001至D-57.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHFCF_3$, A_2 是CH, R_3 是H, X 是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0727] 表D-58提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-58.001至D-58.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHFCF_3$, A_2 是CH, R_3 是Me, X 是S, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0728] 表D-59提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-59.001至D-59.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHFCF_3$, A_2 是CH, R_3 是Me, X 是SO, R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0729] 表D-60提供了具有式I-Qb-2的21种化合物D-60.001至D-60.021,其中 R_2 是 $CH_2CF_2CHFCF_3$, A_2 是CH, R_3 是Me, X 是 SO_2 , R_1 是乙基并且 Q_1 是如表Z中定义的。
- [0730] 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,即使是在低的施用比率下,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性的动物有害生物(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。

[0731] 以上提及的动物有害生物的实例是:

[0732] 来自蜱螨目,例如,

[0733] 下毛瘿螨属物种(*Acalitus* spp.)、针刺瘿螨属物种(*Aculus* spp.)、窄瘿螨属物种(*Acaricalus* spp.)、瘤瘿螨属物种(*Aceria* spp.)、粗脚粉螨(*Acarus siro*)、钝眼蜱属物种(*Amblyomma* spp.)、锐缘蜱属物种(*Argas* spp.)、牛蜱属物种(*Boophilus* spp.)、短须螨属物种(*Brevipalpus* spp.)、苔螨属物种(*Bryobia* spp.)、上三脊瘿螨属物种(*Calipitrimerus* spp.)、皮螨属物种(*Chorioptes* spp.)、鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*)、表皮螨属物种(*Dermatophagoidea* spp.)、始叶螨属物种(*Eotetranychus* spp.)、瘿螨属物种(*Eriophyes* spp.)、半跗线螨属物种(*Hemitarsonemus* spp.)、璃眼蜱属物种(*Hyalomma* spp.)、硬蜱属物种(*Ixodes* spp.)、小爪螨属物种(*Olygonychus* spp.)、钝缘蜱属物种(*Ornithodoros* spp.)、侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonema latus*)、全爪螨属物种(*Panonychus* spp.)、桔芸锈螨(*Phyllocoptruta oleivora*)、植食螨属物种(*Phytonemus* spp.)、多食跗线螨属物种(*Polyphagotarsonemus* spp.)、痒螨属物种(*Psoroptes* spp.)、扇头蜱属物种(*Rhipicephalus* spp.)、根螨属物种(*Rhizoglyphus* spp.)、疥螨属物种(*Sarcoptes* spp.)、狭跗线螨属物种(*Steneotarsonemus* spp.)、跗线螨属物种(*Tarsonemus* spp.)以及叶螨属物种(*Tetranychus* spp.);

[0734] 来自虱目,例如,

[0735] 血虱属物种(*Haematopinus* spp.)、长颚虱属物种(*Linognathus* spp.)、人虱属物种(*Pediculus* spp.)、瘿绵蚜属物种(*Pemphigus* spp.)以及根瘤蚜属物种(*Phylloxera* spp.);

[0736] 来自鞘翅目,例如,

[0737] 叩甲属物种(*Agriotes* spp.)、欧洲鳃角金龟(*Amphimallon majale*)、东方异丽金龟(*Anomala orientalis*)、花象属物种(*Anthonomus* spp.)、蜉金龟属物种(*Aphodius* spp.)、玉米拟花萤(*Astylus atromaculatus*)、金龟属物种(*Ataenius* spp.)、甜菜隐食甲(*Atomaria linearis*)、甜菜胫跳甲(*Chaetocnema tibialis*)、萤叶甲属物种(*Cerotoma* spp.)、宽胸叩头虫属物种(*Conoderus* spp.)、根颈象属物种(*Cosmopolites* spp.)、绿花金龟(*Cotinis nitida*)、象虫属物种(*Curculio* spp.)、圆头犀金龟属物种(*Cyclocephala* spp.)、皮蠹属物种(*Dermestes* spp.)、根萤叶甲属物种(*Diabrotica* spp.)、阿根廷兜虫(*Diloboderus abderus*)、食植瓢虫属物种(*Epilachna* spp.)、*Eremnus*属物种、黑异爪蔗金龟(*Heteronychus arator*)、咖啡果小蠹(*Hypothenemus hampei*)、*Lagria vilosa*、马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata*)、稻水象属物种(*Lissorhoptrus* spp.)、*Liogenys*属物种、*Maecolaspis*属物种、栗色绒金龟(*Maladera castanea*)、美洲叶甲属物种(*Megascelis* spp.)、油菜花露尾甲(*Melighetes aeneus*)、鳃金龟属物种(*Melolontha* spp.)、*Myochrous*

armatus、锯谷盗属物种(*Oryzaephilus* spp.)、耳喙象属物种(*Otiorhynchus* spp.)、鳃角金龟属物种(*Phyllophaga* spp.)、斑象属物种(*Phlyctinus* spp.)、弧丽金龟属物种(*Popillia* spp.)、蚤跳甲属物种(*Psylliodes* spp.)、*Rhyssomatus aubtilis*、劫根蠹属物种(*Rhizopertha* spp.)、金龟子科(*Scarabeidae*)、米象属物种(*Sitophilus* spp.)、麦蛾属物种(*Sitotroga* spp.)、伪切根虫属物种(*Somaticus* spp.)、尖隐喙象属物种、大豆茎象(*Sternechus subsignatus*)、拟步行虫属物种(*Tenebrio* spp.)、拟谷盗属物种(*Tribolium* spp.)以及斑皮蠹属物种(*Trogoderma* spp.)；

[0738] 来自双翅目,例如,

[0739] 伊蚊属物种(*Aedes* spp.)、疟蚊属物种(*Anopheles* spp.)、高粱芒蚊(*Antherigona soccata.*)、橄榄果实蝇(*Bactrocea oleae*)、花园毛蚊(*Bibio hortulanus*)、迟眼蕈蚊属物种(*Bradysia* spp.)、红头丽蝇(*Calliphora erythrocephala*)、小条实蝇属物种(*Ceratitis* spp.)、金蝇属物种(*Chrysomya* spp.)、库蚊属物种(*Culex* spp.)、黄蝇属物种(*Cuterebra* spp.)、寡鬃实蝇属物种(*Dacus* spp.)、地种蝇属物种(*Delia* spp.)、黑腹果蝇(*Drosophilamelanogaster*)、厕蝇属物种(*Fannia* spp.)、胃蝇属物种(*Gastrophilus* spp.)、*Geomyza tripunctata*、舌蝇属物种(*Glossina* spp.)、皮蝇属物种(*Hypoderma* spp.)、虱蝇属物种(*Hyppobosca* spp.)、斑潜蝇属物种(*Liriomyza* spp.)、绿蝇属物种(*Lucilia* spp.)、黑潜蝇属物种(*Melanagromyza* spp.)、家蝇属物种(*Musca* spp.)、狂蝇属物种(*Oestrus* spp.)、瘿蚊属物种(*Orseolia* spp.)、瑞典麦秆蝇(*Oscinella frit*)、藜泉蝇(*Pegomyia hyoscyami*)、草种蝇属物种(*Phorbia* spp.)、绕实蝇属物种(*Rhagoletis* spp.)、*Rivelia quadrifasciata*、*Scatella*属物种、尖眼蕈蚊属物种(*Sciara* spp.)、螫蝇属物种(*Stomoxys* spp.)、虻属物种(*Tabanus* spp.)、绦虫属物种(*Tannia* spp.)以及大蚊属物种(*Tipula* spp.)；

[0740] 来自半翅目,例如,

[0741] 瘤缘蝽(*Acanthocoris scabrator*)、绿蝽属物种、苜蓿盲蝽、土黄缘蝽、海虾盾缘蝽(*Bathypocheilus thalassina*)、土长蝽属物种、臭虫属物种、*Clavigralla tomentosicollis*、盲蝽属物种(*Creontiades* spp.)、可可瘤盲蝽、*Dichelops furcatus*、棉红蝽属物种、埃德萨属物种、美洲蝽属物种(*Euschistus* spp.)、六斑菜蝽(*Eurydema pulchrum*)、扁盾蝽属物种、茶翅蝽、具凹巨股长蝽(*Horcias nobilellus*)、稻缘蝽属物种、草盲蝽属物种、热带硕蚱属物种、卷心菜斑色蝽(*Murgantia histrionic*)、新长缘蝽属物种(*Neomegalotomus* spp.)、烟盲蝽(*Nesidiocoris tenuis*)、绿蝽属物种、拟长蝽(*Nysius simulans*)、海岛蝽象(*Oebalus insularis*)、皮蝽属物种、壁蝽属物种、红猎蝽属物种、可可褐盲蝽、栗土蝽(*Scaptocoris castanea*)、黑蝽属物种(*Scotinophara* spp.)、*Thyanta*属物种、锥鼻虫属物种、木薯网蝽(*Vatiga illudens*)；

[0742] 豌豆无网长管蚜(*Acyrtosium pisum*)、*Adalges*属物种、*Agalliana ensigera*、塔尔吉隆脉木虱、粉虱属物种(*Aleurodicus* spp.)、刺粉虱属物种(*Aleurocanthus* spp.)、甘蔗穴粉虱、软毛粉虱(*Aleurothrixus floccosus*)、甘蓝粉虱(*Aleyrodes brassicae*)、棉叶蝉(*Amarasca biguttula*)、檬果长突叶蝉、肾圆盾蚱属物种、蚜科、蚜属物种、圆盾蚱属物种(*Aspidiotus* spp.)、茄沟无网蚜、马铃薯/番茄木虱(*Bactericera cockerelli*)、小粉虱属物种、短尾蚜属物种(*Brachycaudus* spp.)、甘蓝蚜、喀木虱属物种、双尾蚜(*Cavariella*

aegopodii Scop.)、蜡蚧属物种、黑褐圆盾蚧、橙褐圆盾蚧、大叶蝉属物种、大白叶蝉 (Cofana spectra)、隐瘤蚜属物种、叶蝉属物种、褐软蚧、玉米黄翅叶蝉、裸粉虱属物种、柑橘木虱、麦双尾蚜、西圆尾蚜属物种、小绿叶蝉属物种、苹果绵蚜、葡萄斑叶蝉属物种、Gascardia属物种、赤桉木虱 (Glycaspis brimblecombei)、菜缢管蚜 (Hyadaphis pseudobrassicae)、大尾蚜属物种 (Hyalopterus spp.)、超瘤蚜种 (Hyperomyzus pallidus)、檬果绿叶蝉 (Idioscopus clypealis)、非洲叶蝉、灰飞虱属物种、水土坚蚧、蛎盾蚧属物种、萝卜蚜 (Lopaphis erysimi)、Lyogenys maidis、长管蚜属物种、沫蝉属物种、蛾蜡蝉科 (Metcalfa pruinosa)、麦无网蚜、麦蜡蝉、瘤蚜属物种、新声蚜属物种 (Neotoxoptera sp)、黑尾叶蝉属物种、褐飞虱属物种 (Nilaparvata spp.)、梨大绿蚜、Odonaspis ruthae、甘蔗棉蚜、杨梅缘粉虱、考氏木虱、片盾蚧属物种、瘿绵蚜属物种、玉米蜡蝉、扁角飞虱属物种、忽布疣蚜、根瘤蚜属物种 (Phylloxera spp)、动性球菌属物种、桑白盾蚧属物种、粉蚧属物种、棉跳盲蝽 (Pseudatomoscelis seriatus)、木虱属物种、棉蚧 (Pulvinaria aethiopica)、齿盾蚧属物种、Quesada gigas、电光叶蝉 (Recilia dorsalis)、缢管蚜属物种、黑盔蚧属物种、带叶蝉属物种、二叉蚜属物种、麦蚜属物种 (Sitobion spp.)、白背飞虱、三角苜蓿跳虫 (Spissistilus festinus)、条斑飞虱 (Tarophagus Proserpina)、声蚜属物种、粉虱属物种、Tridiscus sporoboli、葵粉蚧属物种 (Trionymus spp.)、非洲木虱、矢尖蚧、火焰斑叶蝉、Zyginidia scutellaris;

[0743] 来自膜翅目, 例如,

[0744] 顶切叶蚁属 (Acromyrmex)、三节叶蜂属物种 (Arge spp.)、切叶蚁属物种 (Atta spp.)、茎叶蜂属物种 (Cephus spp.)、松叶蜂属物种 (Diprion spp.)、锯角叶蜂科 (Diprionidae)、松叶蜂 (Gilpinia polytoma)、实叶蜂属物种 (Hoplocampa spp.)、毛蚁属物种 (Lasius spp.)、小黄家蚁 (Monomorium pharaonis)、新松叶蜂属物种 (Neodiprion spp.)、农蚁属物种 (Pogonomyrmex spp)、红火蚁、水蚁属物种 (Solenopsis spp.) 以及胡蜂属物种 (Vespa spp.);

[0745] 来自等翅目, 例如,

[0746] 家白蚁属物种 (Coptotermes spp)、白蚁 (Cornitermes cumulans)、楹白蚁属物种 (Incisitermes spp)、大白蚁属物种 (Macrotermes spp)、澳白蚁属物种 (Mastotermes spp)、小白蚁属物种 (Microtermes spp)、散白蚁属物种 (Reticulitermes spp.); 热带火蚁 (Solenopsis geminate)

[0747] 来自鳞翅目 (Lepidoptera), 例如,

[0748] 长翅卷蛾属物种、褐带卷蛾属物种、透翅蛾属物种、地夜蛾属物种、棉叶虫、Amylois属物种、黎豆夜蛾、黄卷蛾属物种、银蛾属物种 (Argyresthia spp.)、带卷蛾属物种、丫纹夜蛾属物种、棉潜蛾、玉米楷夜蛾、粉斑螟蛾、桃蛀果蛾、禾草螟属物种、色卷蛾属物种、越蔓桔草螟 (Chrysoteuchia topiaria)、葡萄果蠹蛾、卷叶螟属物种、云卷蛾属物种、纹卷蛾属物种、鞘蛾属物种、篱笆豆粉蝶 (Colias lesbia)、小造桥夜蛾 (Cosmophila flava)、草螟属物种、大菜螟、苹果异形小卷蛾、黄杨木蛾、小卷蛾属物种、黄杨绢野螟、杆草螟属物种、苏丹棉铃虫、钻夜蛾属物种、甘薯秆螟、粉斑螟属物种、叶小卷蛾属物种 (Epinotia spp.)、盐泽灯蛾 (Estigmene acrea)、Etiella zinckinella、花小卷蛾属物种、环针单纹卷蛾、黄毒蛾属物种、切根虫属物种、Feltia jaculiferia、小食心虫属物种 (Grapholita

spp.)、云雾广翅小卷蛾、实夜蛾属物种、菜螟、切叶野螟属物种 (*Herpetogramma* spp.)、美国白蛾、番茄蠹蛾、*Lasmopalpus lignosellus*、旋纹潜叶蛾、潜叶细蛾属物种、葡萄花翅小卷蛾、*Loxostege bifidalis*、毒蛾属物种、潜蛾属物种、幕枯叶蛾属物种 (*Malacosoma* spp.)、甘蓝夜蛾、烟草天蛾、光腹夜蛾属物种 (*Mythimna* spp.)、夜蛾属物种、秋尺蛾属物种、*Orniodes indica*、欧洲玉米螟、超小卷蛾属物种、褐卷蛾属物种、小眼夜蛾、蛀茎夜蛾、红铃麦蛾、咖啡潜叶蛾、一星黏虫、马铃薯麦蛾、菜粉蝶、粉蝶属物种、小菜蛾、小白巢蛾属物种、尺叶蛾属物种、薄荷灰夜蛾 (*Rachiplusia nu*)、西方豆地香 (*Richia albicosta*)、白禾螟属物种 (*Scirpophaga* spp.)、蛀茎夜蛾属物种、长须卷蛾属物种、灰翅夜蛾属物种、棉大卷叶螟、兴透翅蛾属物种、异舟蛾属物种、卷蛾属物种、粉纹夜蛾、番茄斑潜蝇、以及巢蛾属物种；

[0749] 来自食毛目 (*Mallophaga*)，例如，

[0750] 畜虱属物种 (*Damalinea* spp.) 和啮毛虱属物种 (*Trichodectes* spp.)；

[0751] 来自直翅目 (*Orthoptera*)，例如，

[0752] 蠊属物种 (*Blatta* spp.)、小蠊属物种 (*Blattella* spp.)、蝼蛄属物种 (*Gryllotalpa* spp.)、马德拉蜚蠊 (*Leucophaea maderae*)、飞蝗属物种 (*Locusta* spp.)、北痣蟋蟀 (*Neocurtilla hexadactyla*)、大蠊属物种 (*Periplaneta* spp.)、痣蟋蟀属物种 (*Scapteriscus* spp.)、以及沙漠蝗属物种 (*Schistocerca* spp.)；

[0753] 来自啮虫目 (*Psocoptera*)，例如，

[0754] 虱啮属物种 (*Liposcelis* spp.)；

[0755] 来自蚤目 (*Siphonaptera*)，例如，

[0756] 角叶蚤属物种 (*Ceratophyllus* spp.)、栉头蚤属物种 (*Ctenocephalides* spp.) 以及开皇客蚤 (*Xenopsylla cheopis*)；

[0757] 来自缨翅目 (*Thysanoptera*)，例如，

[0758] *Calliothrips phaseoli*、花蓟马属物种 (*Frankliniella* spp.)、阳蓟马属物种 (*Heliothrips* spp.)、褐带蓟马属物种 (*Hercinothrips* spp.)、单亲蓟马属物种 (*Parthenothrips* spp.)、非洲桔硬蓟马 (*Scirtothrips aurantii*)、大豆蓟马 (*Sericothrips variabilis*)、带蓟马属物种 (*Taeniothrips* spp.)、蓟马属物种 (*Thrips* spp.)；

[0759] 来自缨尾目 (*Thysanura*)，例如，衣鱼 (*Lepisma saccharina*)。

[0760] 根据本发明的活性成分可用于控制、即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。

[0761] 特别地，适合的目标作物是，谷物，如小麦、大麦、黑麦、燕麦、稻、玉蜀黍或高粱；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、罌粟、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。

[0762] 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。

[0763] 例如,本发明可以用于任何以下观赏植物物种:藿香蓟属物种、假面花属物种(*Alonsoa* spp.)、银莲花属物种、南非葵(*Anisodonteia capsensis*)、春黄菊属物种、金鱼草属物种、紫菀属物种、秋海棠属物种(例如丽格海棠、四季秋海棠、球根秋海棠(*B. tuberosus*))、叶子花属物种、雁河菊属物种(*Brachycome* spp.)、芸苔属物种(观赏植物)、蒲包草属物种、辣椒、长春花、美人蕉属物种、矢车菊属物种、菊属物种、瓜叶菊属物种(银叶菊(*C. maritime*))、金鸡菊属物种、红景天(*Crassula coccinea*)、火红萼距花(*Cuphea ignea*)、大丽花属物种、翠雀属物种、荷包牡丹、彩虹菊属物种(*Dorotheantus* spp.)、洋桔梗、连翘属物种、倒挂金钟属物种、老鹳草属鼠麴草属(*Geranium gnaphalium*)、大丁草属物种、千日红、天芥菜属物种、向日葵属物种、木槿属物种、绣球花属物种、绣球属物种、嫣红蔓、凤仙花属物种(非洲凤仙花)、血苋属物种(*Iresines* spp.)、伽蓝菜属物种、马缨丹、三月花葵、狮耳花、百合属物种、松叶菊属物种、沟酸浆属物种、美国薄荷属物种、龙面花属物种、万寿菊属物种、石竹属物种(康乃馨)、美人蕉属物种、酢浆草属物种、雏菊属物种、天竺葵属物种(盾叶天竺葵、马蹄纹天竺葵)、堇菜属物种(三色堇)、碧冬茄属物种、草夹竹桃属物种、香茶菜属物种(*Plecthranthus* spp.)、一品红属物种、爬山虎属物种(五叶爬山虎、爬山虎)、报春花属物种、毛茛属物种、杜鹃花属物种、蔷薇属物种(玫瑰)、黄雏菊属物种、非洲堇属物种、鼠尾草属物种、紫扇花(*Scaevola aemola*)、蛾蝶花(*Schizanthus wisetonensis*)、景天属物种、茄属物种、苏非尼亚矮牵牛属物种(*Surfinia* spp.)、万寿菊属物种、烟草属物种、马鞭草属物种、百日草属物种以及其他花坛植物。

[0764] 例如,本发明可以用于任何以下蔬菜物种:葱属物种(大蒜、洋葱、火葱(*A. oschaninii*))、韭葱、小葱、大葱)、茴香芹、旱芹、芦笋、甜菜、芸苔属物种(甘蓝、大白菜、芜菁)、辣椒、鹰嘴豆、苦苣、菊苣属物种(菊苣、苦苣)、西瓜、黄瓜属物种(黄瓜、甜瓜)、南瓜属物种(西葫芦、印度南瓜)、菜蓟属物种(朝鲜蓟、刺苞菜蓟)、野胡萝卜、茴香、金丝桃属物种、莴苣、番茄属物种(番茄、圣女果番茄)、薄荷属物种、罗勒、香芹、菜豆属物种(菜豆、荷包豆)、豌豆、萝卜、食用大黄、迷迭香属物种、鼠尾草属物种、黑婆罗门参、茄子、菠菜、新缬草属物种(莴苣缬草、*V. eriocarpa*)以及蚕豆。

[0765] 优选的观赏植物物种包括非洲堇(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、堇菜属、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)。

[0766] 根据本发明的这些活性成分尤其适合于控制棉花、蔬菜、玉蜀黍、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(*Leptinotarsa*) (优选地在马铃薯上)以及二化螟(优选地在水稻上)。

[0767] 根据本发明的这些活性成分尤其适合于控制棉花、蔬菜、玉蜀黍、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(*Leptinotarsa*) (优选地在马铃薯上)以及二化螟(优选地在水稻上)。

[0768] 在另一方面中,本发明还可涉及一种控制由植物寄生线虫(内寄生线虫、半内寄生线虫和外寄生线虫)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*)、罗柏氏盘线虫(*Rotylenchus robustus*)、肾形盘线虫(*Rotylenchus reniformis*)以及其他盘线虫属(*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(*Paratrachodorus*)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,如亚粒线虫属物种(*Subanguina spp.*)、根结线虫属物种(*Hypsoperine spp.*)、大刺环线虫属物种(*Macroposthonia spp.*)、矮化线虫属物种(*Melinius spp.*)、刻点胞囊属物种(*Punctodera spp.*)、以及五沟线虫属物种(*Quinisulcius spp.*)。

[0769] 本发明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*。

[0770] 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。

[0771] 可由这样的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 δ -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,例如光杆状菌属物种(*Photorhabdus spp.*)或致病杆菌属物种(*Xenorhabdus spp.*),诸如发光杆菌(*Photorhabdus luminescens*)、嗜线虫致病杆菌(*Xenorhabdus nematophilus*);由动物产生的毒素,诸如蝎毒素、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(agglutinin);蛋白酶抑制剂,诸如胰蛋白酶抑制剂、丝蛋白酶抑制剂、马铃薯糖蛋白、朊抑制素、木瓜蛋白酶抑制剂;核糖体失活蛋白(RIP),诸如蓖麻毒素、玉蜀黍-RIP、相思豆毒素、丝瓜籽毒蛋白、皂草毒素蛋白或异株泻根毒蛋白;类固醇代谢酶,如3-羟基类固醇氧化酶、蜕化类固醇-UDP-糖基-转移酶、胆固醇氧化酶、蜕化素抑制剂、HMG-COA-还原酶、离子通道阻断剂诸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。

[0772] 在本发明的背景下, δ -内毒素(例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C)或营养期杀昆虫蛋白(Vip)(例如Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A)应理解为显然还包括混合型毒素、截短的毒素和经修饰的毒素。混合型毒素是通过那些蛋白的不同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替代。在这种情况下，氨基酸替代中，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，一种组织蛋白酶-G-识别序列被插入Cry3A毒素中(参见WO 03/018810)。

[0773] 这样的毒素或能够合成这样的毒素的转基因植物的实例披露于例如EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451 878以及WO 03/052073中。

[0774] 用于制备这样的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。

[0775] 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)。

[0776] 包含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。这样的植物的实例是：**YieldGard®**(玉蜀黍品种，表达Cry1Ab毒素)；**YieldGardRootworm®**(玉蜀黍品种，表达Cry3Bb1毒素)；**YieldGard Plus®**(玉蜀黍品种，表达Cry1Ab和Cry3Bb1毒素)；**Starlink®**(玉蜀黍品种，表达Cry9C毒素)；**Herculex I®**(玉蜀黍品种，表达Cry1Fa2毒素和获得对除草剂草铵膦耐性的酶膦丝菌素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®**。

[0777] 这样的转基因作物的另外的实例是：

[0778] 1. Bt11玉蜀黍，来自先正达种子子公司(Syngenta Seeds SAS)，霍比特路(Chemin de l'Hobit)27，F-31 790圣苏维尔(St. Sauveur)，法国，登记号C/FR/96/05/10。遗传修饰的玉蜀黍，通过转基因表达截短的Cry1Ab毒素，使之能抵抗欧洲玉米螟(玉米螟和粉茎螟)的侵袭。Bt11玉蜀黍还转基因表达PAT酶以获得对除草剂草铵膦的耐受性。

[0779] 2. Bt176玉蜀黍，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玉蜀黍还转基因表达酶PAT以获得对除草剂草铵膦的耐受性。

[0780] 3. MIR604玉蜀黍，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蜀黍。此毒素是通过插入组织蛋白酶-G-蛋白酶识别序列而经修饰的Cry3A055。这样的转基因玉蜀黍植物的制备描述于WO 03/018810中。

[0781] 4. MON 863玉蜀黍，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。

[0782] 5. IPC 531棉花，来自孟山都欧洲公司，270-272特弗伦大道，B-1150布鲁塞尔，比

利时,登记号C/ES/96/02。

[0783] 6.1507玉蜀黍,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。遗传修饰的玉蜀黍,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。

[0784] 7.NK603×MON 810玉蜀黍,来自孟山都欧洲公司270-272特弗伦大道,B-1150布鲁塞尔,比利时,登记号C/GB/02/M3/03。通过将遗传修饰的品种NK603和MON 810杂交,由常规育种的杂交玉蜀黍品种构成。NK603×MON 810玉蜀黍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,包括欧洲玉蜀黍螟。

[0785] 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。

[0786] 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。

[0787] 作物也可以经修饰以增强对真菌(例如镰孢霉属、炭疽病或疫霉属)、细菌(例如假单胞菌属)或病毒(例如马铃薯卷叶病毒、番茄斑萎病毒、黄瓜花叶病毒)病原体的抗性。

[0788] 作物还包括对线虫(如大豆异皮线虫)具有增强的抗性的那些作物。

[0789] 具有对非生物性胁迫的耐受性的作物包括例如通过NF-YB或本领域中已知的其他蛋白质的表达对于干旱、高盐、高温、寒冷、霜或光辐射具有增强的耐受性的那些作物。

[0790] 可由这样的转基因植物表达的抗病原物质包括例如离子通道阻断剂,如钠通道和钙通道的阻断剂,例如病毒KP1、KP4或KP6毒素;芪合酶;联苯合酶;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)。

[0791] 根据本发明的组合物的另外的使用领域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伤害。

[0792] 本发明还提供了用于控制有害生物(如蚊和其他的疾病媒介物;同样参见http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/)的方法。在一个实施例中,用于控制有害生物的方法包括通过涂刷、轧制、喷雾、涂布或浸渍,向目标有害生物、它们的场所或表面或基底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(如墙、天花板或地板表面)的IRS(室内残留喷雾)施用。在另一个实施例中,考虑到了将这样的组合物施用于如下基底,如无纺或织物材料,该材料处于网织品、被覆物、被褥、窗帘以及帐篷的形式(或可以用于在这些物品的制造中)。

[0793] 在一个实施例中,用于控制这样的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底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底上提供有效的残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残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底上的有害生物的残留控制,该基底是如处于网织品、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。

[0794] 有待处理的基底(包括无纺布、织物或网织品)可以由天然纤维,如棉花、拉菲亚树叶纤维、黄麻、亚麻、剑麻、粗麻布或羊毛,或者合成纤维,如聚酰胺、聚酯、聚丙烯、聚丙烯腈等等制成。聚酯是特别适合的。纺织品处理的方法是已知的,例如WO 2008/151984、WO 2003/034823、US 5631072、WO 2005/64072、WO 2006/128870、EP 1724392、WO 2005113886或WO 2007/090739。

[0795] 根据本发明的组合物的另外的使用领域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。

[0796] 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:

[0797] 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
[0798] 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

[0799] 表B.具有经济重要性的本地蛀木虫的实例。

[0800]

科	种	受感染的宿主或作物
吉丁虫科	<i>桦铜窄吉丁 (Agrilus anxius)</i>	桦树
	<i>磨光窄吉丁 (Agrilus politus)</i>	柳树、枫树
	<i>Agrilus sayi</i>	杨梅、香蕨木
	<i>Agrilus vittaticollis</i>	苹果树、梨树、蔓越橘、唐棣、山楂树
	<i>革扁头吉丁 (Chrysobothris femorata)</i>	苹果、杏、山毛榉、白蜡槭、樱桃树、栗树、红醋栗树、榆树、山楂树、朴树、山核桃树、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	<i>对山毛榉天牛 (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
	<i>虎橡天牛 (Goes tigrinus)</i>	橡树
	<i>黑腹尼虎天牛 (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、

[0801]

科	种	受侵染的宿主或作物
		奥塞奇橙木 (Osage-orange)、黄樟、紫丁香、短叶紫杉 (Mountain-mahogany)、梨树、樱桃树、李子树、桃树、苹果树、榆树、菩提树、枫香
	三线无花果天牛 (<i>Neoptychodes trilineatus</i>)	无花果树、赤杨木、桑树、柳树、网叶朴树 (Netleaf hackberry)
	灰翅筒天牛 (<i>Oberea ocellata</i>)	漆树、苹果树、桃树、李子树、梨树、红醋栗树、黑莓
	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、山毛榉、梨树
	黄带芳小蠹 (<i>Monarthrum fasciatum</i>)	橡树、枫树、桦树、栗树、枫

科	种	受侵染的宿主或作物
		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、欧洲花椒树
	<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
[0802] 透翅蛾科	<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
	<i>Synanthedon rubrofuscia</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、欧洲花椒树、芙蓉属、柳树、苹果树、枇杷树、九层皮、杨梅
	<i>葡萄根透翅蛾 (Vitacea polistiformis)</i>	葡萄树

[0803] 本发明还可以用于控制任何可能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、蚜、沫蝉、南方麦小蠹以及蛴螬。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。

[0804] 特别地,本发明可用于控制用草坪草的根部喂养的昆虫有害生物,这些昆虫有害生物包括蛴螬 (如圆头犀金龟属物种 (*Cyclocephala* spp.) (例如标记的金龟子、*C. lurida*)、*Rhizotrogus* 属物种 (例如欧洲金龟子, 欧洲切根鳃金龟 (*R. majalis*))、黄栌属物种 (例如绿六月甲虫 (Green June beetle)、绿六月花金龟 (*C. nitida*))、弧丽金龟属物种 (*Popillia* spp.) (例如日本甲虫、日本弧丽金龟 (*P. japonica*))、鳃角金龟属物种 (*Phyllophaga* spp.) (例如五月/六月甲虫)、金龟属物种 (例如草坪草黑金龟 (*Black turfgrass ataenius*)、黑绒金龟)、绒毛金龟属物种 (*Maladera* spp.) (例如亚洲花园甲虫

(Asiatic garden beetle)、栗色绒金龟)以及Tomarus属物种)、地珠(热带硕蚘属物种(Margarodes spp.))、蝼蛄(褐黄色的、南方的、以及短翅的;痣蟋蟀属物种(Scapteriscus spp.))、非洲蝼蛄(Gryllotalpa africana))以及大蚊幼虫(leather jackets)(欧洲大蚊(European crane fly)、大蚊属物种(Tipula spp.))。

[0805] 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),和常见粘虫一星黏虫(Pseudaletia unipuncta))、切根虫,象鼻虫(尖隐喙象属物种(Sphenophorus spp.)),诸如S.venatus verstitus和牧草长喙象(S.parvulus))以及草地螟(如草螟属物种(Crambus spp.)和热带草地螟,Herpetogramma phaeopteralis)。

[0806] 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。

[0807] 本发明还可以用于控制草坪草中的其他有害生物,诸如在草坪中创建蚁巢的外引红火蚁(红火蚁(Solenopsis invicta))。

[0808] 在卫生领域中,根据本发明的组合物有效地对抗体表寄生虫如硬蜱、软蜱、疥螨、秋螨、蝇(叮咬和舔舐)、寄生性蝇幼虫,虱、发虱、鸟虱和跳蚤。

[0809] 这样的寄生虫的实例是:

[0810] 虱目:血虱属物种、长颚虱属物种(Linognathus spp.)、人虱属物种以及阴虱属物种(Phtirus spp.)、管虱属物种。

[0811] 食毛目:毛羽虱属物种、短羽虱属物种、鸭虱属物种、牛羽虱属物种、Werneckiella属物种、Lepikentron属物种、畜虱属物种、啮毛虱属物种以及猫羽虱属物种(Felicola spp.)。

[0812] 双翅目及长角亚目(Nematocera)和短角亚目(Brachycera),例如伊蚊属物种(Aedes spp.)、疟蚊属物种、库蚊属物种(Culex spp.)、蚋属物种(Simulium spp.)、真蚋属物种(Eusimulium spp.)、白蛉属物种(Phlebotomus spp.)、罗蛉属物种(Lutzomyia spp.)、库蠓属物种(Culicoides spp.)、斑虻属物种(Chrysops spp.)、驼背虻属物种(Hybomitra spp.)、黄虻属物种(Atylotus spp.)、虻属物种(Tabanus spp.)、麻虻属物种(Haematopota spp.)、Philipomyia属物种、蜂虱蝇属物种(Braula spp.)、家蝇属物种(Musca spp.)、齿股蝇属物种(Hydrotaea spp.)、螫蝇属物种、黑角蝇属物种(Haematobia spp.)、莫蝇属物种(Morellia spp.)、厕蝇属物种(Fannia spp.)、舌蝇属物种(Glossina spp.)、丽蝇属物种(Calliphora spp.)、绿蝇属物种(Lucilia spp.)、金蝇属物种(Chrysomyia spp.)、污蝇属物种(Wohlfahrtia spp.)、麻蝇属物种(Sarcophaga spp.)、狂蝇属物种(Oestrus spp.)、皮蝇属物种(Hypoderma spp.)、胃蝇属物种(Gasterophilus spp.)、虱蝇属物种(Hippobosca spp.)、羊虱蝇属物种(Lipoptena spp.)和蜱蝇属物种(Melophagus spp.)。

[0813] 蚤目(Siphonapterida),例如蚤属物种(Pulex spp.)、栉头蚤属物种、客蚤属物种(Xenopsylla spp.)、角叶蚤属物种。

[0814] 异翅目 (Heteroptera), 例如臭虫属物种、锥鼻虫属物种、红猎蝽属物种、锥蝽属物种 (*Panstrongylus* spp.)。

[0815] 蜚蠊目 (Blattaria), 例如东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*)、美洲大蠊 (*Periplaneta americana*)、德国小蠊 (*Blattella germanica*) 以及夏柏拉蟑螂属物种 (*Supella* spp.)。

[0816] 蜱螨 (Acaria) 亚纲 (螨科 (Acarida)) 和后气门目 (Meta-stigmata) 和中气门目 (Meso-stigmata), 例如锐缘蜱属物种 (*Argas* spp.)、钝缘蜱属物种 (*Ornithodoros* spp.)、耳蜱属物种 (*Otobius* spp.)、硬蜱属物种 (*Ixodes* spp.)、钝眼蜱属物种 (*Amblyomma* spp.)、牛蜱属物种 (*Boophilus* spp.)、革蜱属物种 (*Dermacentor* spp.)、血蜱属物种 (*Haemophysalis* spp.)、璃眼蜱属物种 (*Hyalomma* spp.)、扇头蜱属物种 (*Rhipicephalus* spp.)、皮刺螨属物种 (*Dermanyssus* spp.)、刺利螨属物种 (*Raillietia* spp.)、肺刺螨属物种 (*Pneumonyssus* spp.)、胸刺螨属物种 (*Sternostoma* spp.) 和瓦螨属物种 (*Varroa* spp.)。

[0817] 轴螨目 (Actinedida) (前气门亚目 (Prostigmata)) 和粉螨目 (Acaridida) (无气门亚目 (Astigmata)), 例如蜂盾螨属物种 (*Acarapis* spp.)、姬螯螨属物种 (*Cheyletiella* spp.)、禽螯螨属物种 (*Ornithocheyletia* spp.)、肉螨属物种 (*Myobia* spp.)、疮螨属物种 (*Psorergates* spp.)、蠕形螨属物种 (*Demodex* spp.)、恙螨属物种 (*Trombicula* spp.)、牦螨属物种 (*Listrophorus* spp.)、粉螨属物种 (*Acarus* spp.)、食酪螨属物种 (*Tyrophagus* spp.)、嗜木螨属物种 (*Caloglyphus* spp.)、颈下螨属物种 (*Hypodectes* spp.)、翅螨属物种 (*Pterolichus* spp.)、痒螨属物种 (*Psoroptes* spp.)、皮螨属物种 (*Chorioptes* spp.)、耳痒螨属物种 (*Otodectes* spp.)、疥螨属物种 (*Sarcoptes* spp.)、耳螨属物种 (*Notoedres* spp.)、鸟疥螨属物种 (*Knemidocoptes* spp.)、胞螨属物种 (*Cytodites* spp.) 以及鸡雏螨属物种 (*Laminosioptes* spp.)。

[0818] 根据本发明的组合物还适用于保护在如木材、纺织品、塑料、粘合剂、胶、漆料、纸张和卡片、皮革、地板和建筑等情况下的材料免受昆虫侵染。

[0819] 根据本发明的组合物可以用于, 例如, 对抗以下有害生物: 甲虫, 如北美家天牛 (*Hylotrupes bajulus*)、长毛天牛 (*Chlorophorus pilosis*)、家具窃蠹 (*Anobium punctatum*)、红毛窃蠹 (*Xestobium rufovillosum*)、梳角细脉窃蠹 (*Ptilinuspecticornis*)、*Dendrobium pertinex*、松芽枝窃蠹 (*Ernobius mollis*)、*Priobium carpini*、褐粉蠹 (*Lyctus brunneus*)、非洲粉蠹 (*Lyctus africanus*)、南方粉蠹 (*Lyctus planicollis*)、栎粉蠹 (*Lyctus linearis*)、柔毛粉蠹 (*Lyctus pubescens*)、胸粉蠹 (*Trogoxylon aequale*)、鳞毛粉蠹 (*Minthesrugicollis*)、材小蠹属物种 (*Xyleborus* spec.)、条木小蠹属物种 (*Tryptodendron* spec.)、咖啡黑长蠹 (*Apate monachus*)、榭长蠹 (*Bostrychus capucins*)、棕异翅长蠹 (*Heterobostrychus brunneus*)、双棘长蠹属物种 (*Sinoxylon* spec.) 以及竹长蠹 (*Dinoderus minutus*), 以及还有膜翅类, 如蓝黑树蜂 (*Sirex juvencus*)、大树蜂 (*Urocera gigas*)、泰加大树蜂 (*Urocera gigas taignus*) 和 *Urocera augu*, 以及白蚁类, 如欧洲木白蚁 (*Kaloterme flavicollis*)、麻头堆砂白蚁 (*Cryptotermes brevis*)、印巴结构木异白蚁 (*Heterotermes indicola*)、黄胸散白蚁 (*Reticulitermes flavipes*)、桑特散白蚁 (*Reticulitermes santonensis*)、欧洲散白蚁

(*Reticulitermes lucifugus*)、达尔文澳白蚁 (*Mastotermes darwiniensis*)、内华达古白蚁 (*Zootermopsis nevadensis*) 与家白蚁 (*Coptotermes formosanus*)，以及蛀虫，如衣鱼 (*Lepisma saccharina*)。

[0820] 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辅助剂(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。这样的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。

[0821] 可以通过例如将活性成分与配制辅助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辅助剂(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。

[0822] 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。这使得活性成分能够以受控的量释放(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。它们包含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。包裹的膜可以包含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。

[0823] 适合于制备根据本发明的组合物的配制辅助剂本身是已知的。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、 α -蒎烯、d-蒎烯、乳酸乙酯、乙二醇、乙二醇丁基醚、乙二醇甲基醚、 γ -丁内酯、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、辛酸乙酸酯、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。

[0824] 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。

[0825] 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;烷基萘磺酸酯的盐,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;以及磷酸单烷基酯和二烷基酯的盐;以及还有另外的物质,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)。

[0826] 可以用于杀有害生物配制品的另外的辅助剂包括结晶抑制剂、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。

[0827] 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、这样的油的烷基酯或这样的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的从0.01%到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C₈-C₂₂脂肪酸的烷基酯,尤其是C₁₂-C₁₈脂肪酸的甲基衍生物,例如月桂酸、棕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[除草剂辅助剂纲要],第10版,南伊利诺伊大学,2010。

[0828] 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%的配制辅助剂,该配制辅助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。

[0829] 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的比率施用。

[0830] 优选的配制品可以具有以下组成(重量%):

[0831] 可乳化的浓缩物:

[0832] 活性成分: 1%至95%,优选60%至90%

- [0833] 表面活性剂: 1%至30%,优选5%至20%
- [0834] 液体载体: 1%至80%,优选1%至35%
- [0835] 尘粉剂:
- [0836] 活性成分: 0.1%至10%,优选0.1%至5%
- [0837] 固体载体: 99.9%至90%,优选99.9%至99%
- [0838] 悬浮液浓缩物:
- [0839] 活性成分: 5%至75%,优选10%至50%
- [0840] 水: 94%至24%,优选88%至30%
- [0841] 表面活性剂: 1%至40%,优选2%至30%
- [0842] 可湿性粉剂:
- [0843] 活性成分: 0.5%至90%,优选1%至80%
- [0844] 表面活性剂: 0.5%至20%,优选1%至15%
- [0845] 固体载体: 5%至95%,优选15%至90%
- [0846] 颗粒剂:
- [0847] 活性成分: 0.1%至30%,优选0.1%至15%
- [0848] 固体载体: 99.5%至70%,优选97%至85%
- [0849] 以下实例进一步说明了(但不限制)本发明。

[0850]

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%	-
高度分散的硅酸	5%	10%	10%
高岭土	62%	27%	-

[0851] 将该组合与这些辅助剂充分混合并且将混合物在适合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。

[0852]

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%
高度分散的硅酸	5%	5%	-
高岭土	65%	40%	-
滑石	-		20%

[0853] 将该组合与辅助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。

[0854]

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%

[0855] 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。

[0856]	<u>尘粉剂</u>	a)	b)	c)
	活性成分	5%	6%	4%
	滑石	95%	-	-
	高岭土	-	94%	-
	矿物填料	-	-	96%

[0857] 通过将该组合与载体混合并且将混合物在适合的研磨机中研磨而获得即用型尘粉剂。这样的粉剂还可以用于种子的干拌种。

[0858]	<u>挤出机颗粒</u>	
	活性成分	15%
	木质素磺酸钠	2%
	羧甲基纤维素	1%
	高岭土	82%

[0859] 将该组合与这些辅助剂混合并且研磨，并且将混合物用水湿润。

[0860] 将混合物挤出并且然后在空气流中干燥。

[0861]	<u>包衣的颗粒</u>	
	活性成分	8%
	聚乙二醇(分子量200)	3%
	高岭土	89%

[0862] 将该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。以此方式获得无尘的包衣的颗粒。

[0863] 悬浮液浓缩物

[0864]	活性成分	40%
	丙二醇	10%
	壬基酚聚乙二醇醚(15mol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%
	水	32%

[0865] 将该精细研磨的组合与辅助剂紧密地混合，得到悬浮液浓缩物，从该悬浮液浓缩物可以通过用水稀释获得任何所希望的稀释度的悬浮液。使用这样的稀释物，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。

[0866] 种子处理用的可流动性浓缩物

[0867] 活性成分	40%
丙二醇	5%
共聚物丁醇PO/E0	2%
三苯乙烯酚,具有10-20摩尔E0	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%

[0868] 将该精细研磨的组合与辅助剂紧密地混合,得到悬浮液浓缩物,从该悬浮液浓缩物可以通过用水稀释获得任何所希望的稀释度的悬浮液。使用这样的稀释物,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。

[0869] 缓释的胶囊悬浮液

[0870] 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。将此混合物在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。向此乳液中添加在5.3份的水中的2.8份的1,6-己二胺混合物。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。介质胶囊的直径是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。

[0871] 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)、乳剂、油包水型乳液(E0)、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辅助剂组合的任何技术上可行的配制品。

[0872] 制备实例:

[0873] “Mp”是指以°C计的熔点。自由基表示甲基。¹H NMR测量值在Bruker 400MHz分光计上记录,化学位移相对于TMS标准品以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。对于每种化合物获得的特征LCMS值是保留时间(“Rt”,以分钟记录)和测量的分子离子(M+H)⁺或(M-H)⁻。

[0874] LCMS方法:

[0875] 方法1:

[0876] 在来自沃特斯公司的质谱仪(SQD单四极杆质谱仪)上记录光谱,其装备有电喷射源(极性:正离子或负离子,全扫描,毛细管电压:3.00kV,锥孔范围:41V,源温度:150°C,去溶剂化温度:500°C,锥孔气体流量:50L/Hr,去溶剂化气体流量:1000L/Hr,质量范围:110至800Da)和来自沃特斯公司的H类UPLC:四元泵,经加热的柱室以及二极管阵列检测器。柱:Acquity UPLC HSS T3 C18,1.8μm,30x2.1mm,温度:40°C,DAD波长范围(nm):200至400,溶剂梯度:A=水+5%乙腈+0.1% HCOOH,B=乙腈+0.05% HCOOH;梯度:0min 10% B;0.-

0.2min 10%-50% B;0.2-0.7min50%-100% B;0.7-1.3min 100% B;1.3-1.4min 100%-10% B;1.4-1.6min 10% B;流量(mL/min)0.6。

[0877] 方法2:

[0878] 在来自安捷伦科技公司(Agilent Technologies)的质谱仪(6410三重四级杆质谱仪)上记录光谱,其装备有电喷射源(极性:正离子或负离子,MS2扫描,毛细管电压:4.00kV,碎裂电压:100V,去溶剂化温度:350℃,气体流量:11L/min,喷雾器气体:45psi,质量范围:110至1000Da)和来自安捷伦公司的1200系列HPLC:四元泵,经加热的柱室以及二极管阵列检测器。柱:KINETEX EVO C18,2.6μm,50x4.6mm,温度:40℃,DAD波长范围(nm):210至400,溶剂梯度:A=水+5%乙腈+0.1% HCOOH,B=乙腈+0.1%HCOOH;梯度:0min 10% B,90%A;0.9-1.8min 100% B;1.8-2.2min 100%-10% B;2.2-2.5min 10% B;流量(mL/min)1.8。

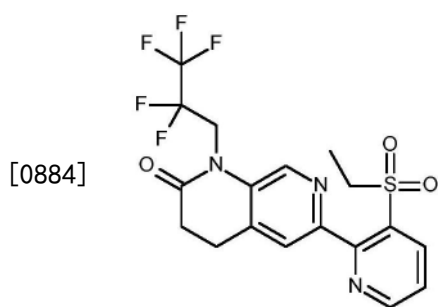
[0879] 方法3:

[0880] 在来自沃特斯公司的质谱仪(Acquity QDa质谱仪)上记录谱图,该质谱仪装备有电喷射源(极性:正和负极性转换,毛细管:0.8kV,锥孔范围:25V,萃取器:V(QDa检测器无萃取器电压),源温度:120℃,去溶剂化温度:600℃,锥孔气体流量:50L/h,去溶剂化气体流量:1000L/h,质量范围:110至850Da)和来自沃特斯公司的Acquity UPLC:四元溶剂管理器,加热柱室,二极管阵列检测器。柱:Waters UPLC HSS T3,1.8μm,30x 2.1mm,温度:40℃,PDA波长范围(nm):230至400,溶剂梯度:A=具有0.1%甲酸的水:乙腈:95:5v/v,B=具有0.05%甲酸的乙腈,梯度:0min-1.0min,10%B-90% A;1.0min-4.50min 10%-100% B;4.51min-5.30min,100%B,0% A;5.31min-5.50min 100%-10% B;5.51min-6.00min,10%B,90% A;流量(ml/min)0.6。

[0881] 方法4:

[0882] 在来自安捷伦科技公司的质谱仪(6410三重四级杆质谱仪)上记录光谱,其装备有电喷射源(极性:正离子或负离子,MS2扫描,毛细管电压:7.00kV,碎裂电压:120V,去溶剂化温度:350℃,气体流量:11L/min,喷雾器气体:40psi,质量范围:110至1000Da)和来自安捷伦公司的1200系列HPLC:四元泵,经加热的柱室以及二极管阵列检测器。柱:KINETEX EVO C18,2.6μm,50x4.6mm,温度:40℃,检测器VWD波长:254nm,溶剂梯度:A=水+5%乙腈+0.1% HCOOH,B=乙腈+0.1% HCOOH;梯度:0min 10%B,90% A;0.9-1.8min 100% B;1.8-2.2min 100%-10% B;2.2-2.5min10% B;流量(mL/min)1.8。

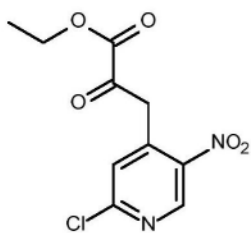
[0883] 实例P1:6-(3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(化合物P1)的制备



(P1)

[0885] 步骤1:3-(2-氯-5-硝基-4-吡啶基)-2-氧代-丙酸乙酯(中间体I-1)的制备

[0886]

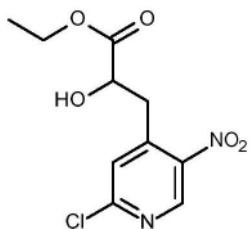


(I-1)

[0887] 在室温下在10分钟的时间段内向在氮气氛下的2-氯-4-甲基-5-硝基吡啶 (CAS 23056-33-9, 1.00g, 5.79mmol) 在草酸二乙酯 (7.59mL, 54.5mmol) 中的溶液中添加1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯 (1.15mL, 7.53mmol)。将反应混合物在室温下搅拌过夜。然后将反应混合物倒入冰冷的水 (10mL) 中, 用2N盐酸 (3mL) 酸化并搅拌5分钟。倾析出溶剂, 并将所得残余物在冰冷的甲醇中搅拌20分钟。将沉淀物过滤并真空干燥, 以得到纯乙基3-(2-氯-5-硝基-4-吡啶基)-2-氧代-丙酸酯。LCMS (方法1): $R_t=0.96\text{min}$, $m/z=271/273$ (M-H)⁻。

[0888] 步骤2: 3-(2-氯-5-硝基-4-吡啶基)-2-羟基-丙酸乙酯 (中间体I-2) 的制备

[0889]

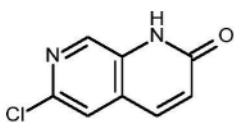


(I-2)

[0890] 在0℃下, 向乙基3-(2-氯-5-硝基-4-吡啶基)-2-氧代-丙酸酯 (如上所述制备的中间体I-1, 0.500g, 1.80mmol) 在四氢呋喃 (4mL) 和水 (1mL) 中的冰冷的溶液中分部分地添加硼氢化钠 (70mg, 1.8mmol)。将反应混合物在0℃下搅拌15分钟。将冰冷的水添加至反应混合物中并将其在0℃下用饱和水性氯化铵淬灭。将所得悬浮液用乙酸乙酯萃取三次。将合并的有机层经硫酸钠干燥, 过滤并真空浓缩, 以得到乙基3-(2-氯-5-硝基-4-吡啶基)-2-羟基-丙酸酯, 其不经进一步纯化而使用。LCMS (方法1): $R_t=0.88\text{min}$, $m/z=275/277$ (M+H)⁺。

[0891] 步骤3: 6-氯-1H-1,7-萘啶-2-酮 (中间体I-3) 的制备

[0892]

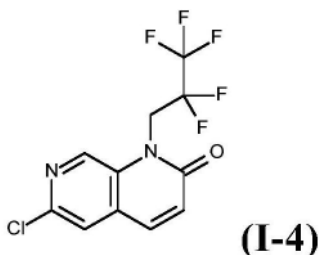


(I-3)

[0893] 在室温下向3-(2-氯-5-硝基-4-吡啶基)-2-羟基-丙酸乙酯 (如上所述制备的中间体I-2, 0.400g, 0.970mmol) 在乙酸 (6mL) 中的溶液中添加铁 (0.220g, 3.90mmol)。将反应混合物加热至70℃持续30分钟。然后在70℃下, 向此反应混合物中添加1,4-二噁烷 (4mL) 和6N盐酸 (3mL)。将温度升至90℃并持续搅拌4小时。冷却至室温后, 将反应混合物经硅藻土过滤, 并用乙酸乙酯洗涤。将滤液减压浓缩。将获得的残余物用水 (20mL) 稀释, 冷却至0℃, 并用饱和水性碳酸氢钠 (25mL) 中和。将悬浮液过滤并减压干燥。将粗残余物溶于乙醇:1,2-二氯乙烷 (1:1, 20mL) 中, 并加热至70℃持续30分钟。将所得热溶液经硅藻土过滤并真空浓缩, 以得到呈棕色固体的6-氯-1H-1,7-萘啶-2-酮。LCMS (方法1): $R_t=0.36\text{min}$, $m/z=181/183$ (M+H)⁺。¹H NMR (400MHz, DMSO-d₆) δ_{ppm} 6.82 (d, 1H) 7.83 (s, 1H) 7.92 (d, 1H) 8.44 (s, 1H) 11.99-12.23 (m, 1H)。

[0894] 步骤4:6-氯-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-萘啶-2-酮(中间体I-4)的制备

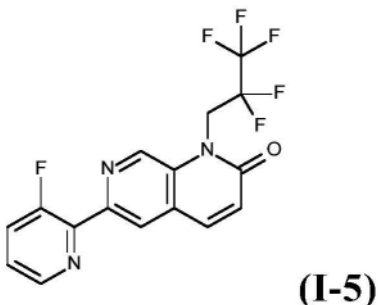
[0895]



[0896] 在室温下,向6-氯-1H-1,7-萘啶-2-酮(如上所述制备的中间体I-3,2.50g,13.8mmol)在四氢呋喃(50mL)中的溶液中添加碳酸钾(4.98g,36.0mmol)和三氟甲磺酸2,2,3,3,3-五氟丙基酯(3.31mL,19.4mmol)。将反应混合物在70℃下搅拌9小时并且然后在50℃下搅拌过夜。冷却至室温后,将其倒入水中并用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层用盐水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将粗品通过combiflash(硅胶,乙酸乙酯,在环己烷中)纯化,以得到6-氯-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-萘啶-2-酮。LCMS(方法1):Rt=0.99min, m/z=313/315(M+H)⁺。¹H NMR(400MHz,氯仿-d) δppm 5.03(br s,2H)6.97(d,1H)7.51(s,1H)7.67(d,1H)8.57(s,1H)。

[0897] 步骤5:6-(3-氟-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-萘啶-2-酮(中间体I-5)的制备

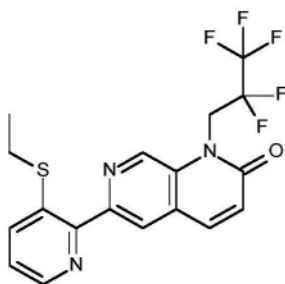
[0898]



[0899] 向6-氯-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-萘啶-2-酮(如上所述制备的中间体I-4,0.800g,2.56mmol)在1,4-二噁烷(15mL)中的溶液中添加2-二环己基膦基-2',4',6'-三异丙基联苯(XPhos)(0.30g,0.61mmol)。将反应混合物在氮气氛围下脱气持续15分钟,随后添加乙酸钯(II)(0.059g,0.26mmol)。在添加三丁基-(3-氟-2-吡啶基)锡烷(1.51g,3.84mmol)之前,将反应混合物再次脱气持续另外15分钟。然后将反应物质加热至90℃并搅拌过夜。冷却至室温后,将其倒入水中并用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层用盐水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将粗品通过combiflash(硅胶,乙酸乙酯,在环己烷中)纯化,以得到6-(3-氟-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-萘啶-2-酮。LCMS(方法1):Rt=0.95min, m/z=374(M+H)⁺。

[0900] 步骤6:6-(3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-萘啶-2-酮(中间体I-6)的制备

[0901]

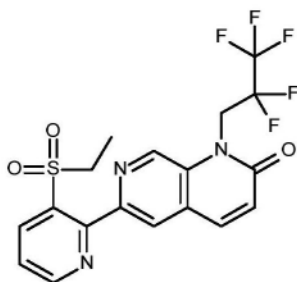


(I-6)

[0902] 在室温下,在氮气氛下,向6-(3-氟-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-萘啶-2-酮(如上所述制备的中间体I-5,0.200g,0.536mmol)在干燥的N,N-二甲基甲酰胺(5mL)中的溶液中添加乙基硫烷基钠(0.110g,1.18mmol)。将反应混合物在室温下搅拌90分钟。然后添加水,并将其用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层用盐水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将粗品通过combiflash(硅胶,乙酸乙酯,在环己烷中)纯化,以得到6-(3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-萘啶-2-酮。LCMS(方法1):Rt=1.07min,m/z=416(M+H)⁺。

[0903] 步骤7:6-(3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-萘啶-2-酮(中间体I-7)的制备

[0904]

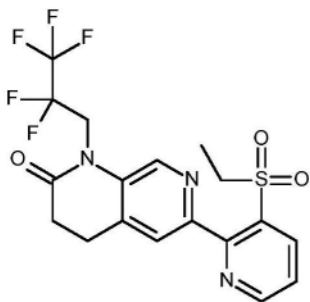


(I-7)

[0905] 在0℃下,向6-(3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-萘啶-2-酮(如上所述制备的中间体I-6,0.065g,0.16mmol)在二氯甲烷(5mL)中的溶液中添加3-氯过苯甲酸(0.085g,0.34mmol)。将反应混合物在室温下搅拌2小时。然后将反应混合物用饱和水性碳酸钾和水淬灭,并用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层用盐水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将粗品通过combiflash(硅胶,乙酸乙酯,在环己烷中)纯化,以得到呈灰白色固体的6-(3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-萘啶-2-酮。LCMS(方法1):Rt=0.97min,m/z=448(M+H)⁺。

[0906] 步骤8:6-(3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(化合物P1)的制备

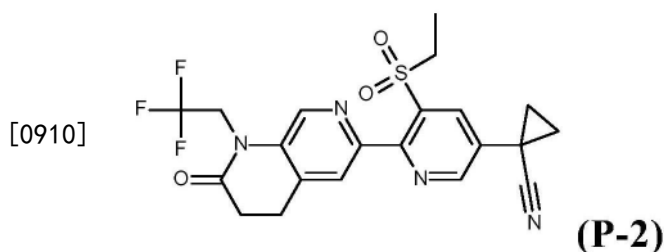
[0907]



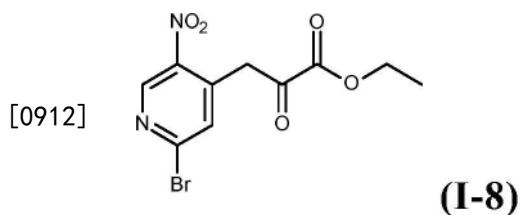
(P1)

[0908] 向6-(3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-萘啶-2-酮(如上所述制备的中间体I-7, 0.025g, 0.055mmol)在四氢呋喃(0.5mL)中的0℃冷却溶液中添加饱和氯化铵水溶液(0.25mL), 随后添加锌(0.036g, 0.558mmol)和催化量的三氟乙酸(0.000638g, 0.0055mmol)。使反应混合物达至室温并搅拌16小时。将反应混合物用饱和水性氯化铵(5mL)淬灭, 并将混合物用乙酸乙酯(3x 10mL)萃取。将合并的有机层经硫酸钠干燥, 过滤并真空浓缩。将粗品通过combiFlash(硅胶, 乙酸乙酯, 在环己烷中)纯化, 以得到呈淡黄色固体的纯6-(3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮。LCMS(方法1): Rt=0.97min, m/z=450 (M+H)⁺。¹H NMR(400MHz, 氯仿-d) δppm 1.40(t, 3H) 2.83(dd, 2H) 3.05-3.12(m, 2H) 3.94(q, 2H) 4.80(br s, 2H) 7.57(dd, 1H) 7.74(s, 1H) 8.39(s, 1H) 8.50(dd, 1H) 8.88(dd, 1H)。

[0909] 实例P2: 1-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈(化合物P2)的制备

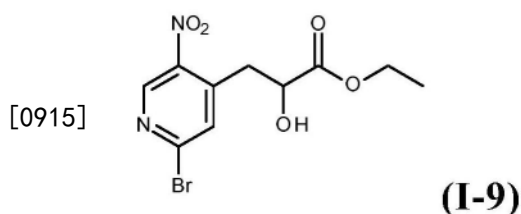


[0911] 步骤1: 乙基3-(2-氯-5-硝基-4-吡啶基)-2-氧代-丙酸酯(中间体I-8)的制备



[0913] 在室温下, 经10分钟的时间段, 向在氮气氛下的2-溴-4-甲基-5-硝基-吡啶(5.00g, 23.0mmol)在草酸二乙酯(30.2mL, 217mmol)中的溶液中添加1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯(4.03mL, 26.5mmol)。将反应混合物在室温下搅拌过夜。然后将反应混合物倒入冰冷的水(50mL)中, 用2N盐酸(20mL)酸化并搅拌15分钟。倾析出溶剂, 并将所得残余物在冰冷的乙醇(50mL)中搅拌20分钟。将沉淀物通过布氏漏斗过滤并真空干燥, 以得到呈固体的纯乙基3-(2-溴-5-硝基-4-吡啶基)-2-氧代-丙酸酯。LCMS(方法1): Rt=0.96min, m/z=317/319 (M+H)⁺。

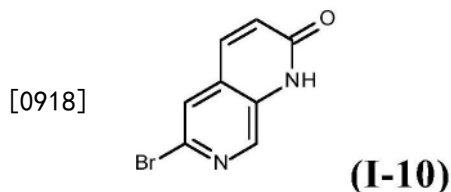
[0914] 步骤2: 乙基3-(2-溴-5-硝基-4-吡啶基)-2-羟基-丙酸酯(中间体I-9)的制备



[0916] 向乙基3-(2-溴-5-硝基-4-吡啶基)-2-氧代-丙酸酯(如上所述制备的中间体I-8, 3.00g, 9.46mmol)在四氢呋喃(60mL)中的0℃冷却溶液中分批添加硼氢化钠(0.438g, 11.4mmol)。允许反应物质经30分钟的时间段缓慢升至5℃。将反应物质用冰冷水(50mL)淬

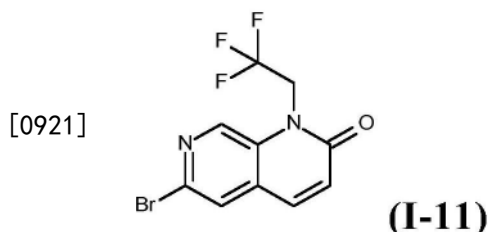
灭,用饱和水性氯化铵(50mL)中和,并将所得悬浮液用乙酸乙酯(3x 100mL)萃取。将合并的有机层经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将粗品通过combiflash(硅胶,15%乙酸乙酯,在环己烷中)纯化,以得到呈淡黄色粘稠油状物的纯乙基3-(2-溴-5-硝基-4-吡啶基)-2-羟基-丙酸酯。LCMS(方法1): $R_t=0.90\text{min}$, $m/z=319/321(\text{M}+\text{H})^+$ 。

[0917] 步骤3:6-溴-1H-1,7-萘啶-2-酮(中间体I-10)的制备



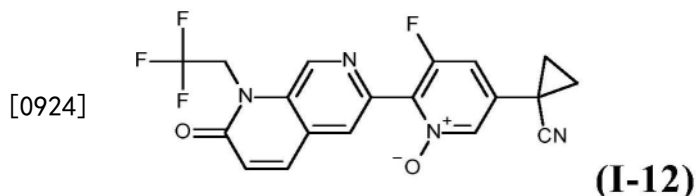
[0919] 在室温下,向乙基3-(2-溴-5-硝基-4-吡啶基)-2-羟基-丙酸酯(如上所述制备的中间体I-9,0.500g,1.57mmol)在乙酸(5mL)中的溶液中添加铁(0.351g,6.27mmol)。将反应混合物加热至70℃持续60分钟。然后在70℃下,向此反应混合物中添加1,4-二噁烷(10mL)和5N盐酸(10mL)。将温度升至90℃并持续搅拌4小时。通过LCMS监测反应进程。LCMS显示部分转化,添加另外的5N盐酸(5mL)并在90℃下再搅拌12小时。冷却至室温后,将反应混合物经硅藻土过滤,并用乙酸乙酯(2x 10mL)洗涤。将滤液减压浓缩。将获得的残余物用水(10mL)稀释,冷却至0℃,并用饱和碳酸氢钠水溶液(35mL)中和。将所得悬浮液用乙酸乙酯(7x 30mL)萃取。将合并的有机层经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将粗化合物通过用正戊烷(3x 5mL)洗涤纯化,真空干燥,以得到呈灰白色固体的6-溴-1H-1,7-萘啶-2-酮。LCMS(方法1): $R_t=0.68\text{min}$, $m/z=225/227(\text{M}+\text{H})^+$ 。

[0920] 步骤4:6-溴-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-萘啶-2-酮(中间体I-11)的制备



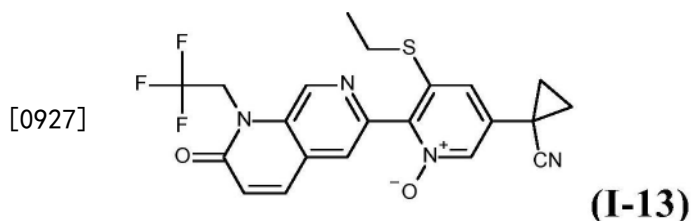
[0922] 在室温下,向6-溴-1H-1,7-萘啶-2-酮(如上所述制备的中间体I-10,6.00g,25.06mmol)在四氢呋喃(60mL)中的溶液中添加碳酸钾(12.12g,87.71mmol),随后添加2,2,2-三氟乙基三氟甲磺酸酯(11.2mL,75.18mmol)。将反应物质在75℃下搅拌5小时。在冷却至室温后,将反应物质真空浓缩,然后用冰冷的水淬灭并用乙酸乙酯(2x 150mL)萃取。将合并的有机层用盐水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将粗品通过combiflash(硅胶,乙酸乙酯,在环己烷中)纯化,以得到6-溴-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-萘啶-2-酮。LCMS(方法1): $R_t=1.01\text{min}$, $m/z=307/309(\text{M}+\text{H})^+$ 。 $^1\text{H NMR}$ (400MHz,氯仿-d) δ_{ppm} 5.00(br d,2H)6.95(d,1H)7.62-7.68(m,2H)8.58(s,1H)。

[0923] 步骤5:1-[5-氟-1-氧负离子基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-萘啶-6-基]吡啶-1-鎓-3-基]环丙烷甲腈(中间体I-12)的制备



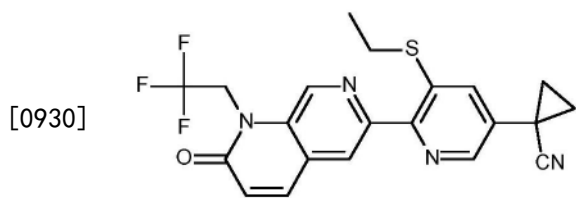
[0925] 将2,2,6,6-四甲基哌啶基氯化锌氯化锂络合物在四氢呋喃(14.6mL,14.65mmol,1mol/l)中的溶液滴加至1-(5-氟-1-氧负离子基-吡啶-1-鎓-3-基)环丙烷甲腈(CAS 2489316-32-5,如WO 2020182577中所述的制备)(2.61g,14.65mmol)在四氢呋喃(30mL)中的脱气溶液中(在10℃下,在氮气下)并搅拌15分钟。在10℃下,将6-溴-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-萘啶-2-酮(如上所述制备的中间体I-11,3.0g,9.76mmol)在四氢呋喃(30mL)中的脱气溶液添加至反应混合物中。在添加完成后,添加Pd(dppf)Cl₂(0.47g,0.63mmol)并将反应物质在60℃下加热15小时。将反应物质用饱和碳酸氢钠水溶液(60mL)淬灭并用乙酸乙酯(3x 60mL)萃取。将合并的有机层用水洗涤,然后用盐水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将粗品通过combiflash(硅胶,0-10%甲醇,在乙酸乙酯中)纯化,以得到1-[5-氟-1-氧负离子基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-萘啶-6-基]吡啶-1-鎓-3-基]环丙烷甲腈以及未反应的1-(5-氟-1-氧负离子基-吡啶-1-鎓-3-基)环丙烷甲腈。将此材料原样用于下一步骤。LCMS(方法1):Rt=0.93min,m/z=405(M+H)⁺。

[0926] 步骤6:1-[5-乙基硫烷基-1-氧负离子基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-萘啶-6-基]吡啶-1-鎓-3-基]环丙烷甲腈(中间体I-13)的制备



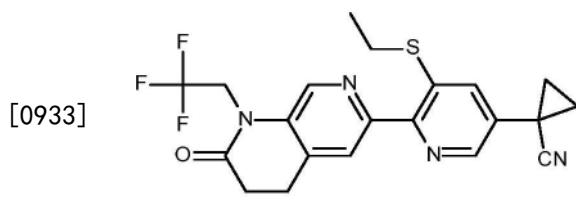
[0928] 在氮气氛下,向1-[5-氟-1-氧负离子基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-萘啶-6-基]吡啶-1-鎓-3-基]环丙烷甲腈(如上所述制备的中间体I-12,2.469g,6.107mmol)在N,N-二甲基甲酰胺(15mL)中的0℃冷却溶液中添加乙硫醇钠(0.770g,9.16mmol)。将反应混合物在室温下搅拌2小时。将反应物质用冰冷水(100mL)淬灭并用乙酸乙酯(3x)萃取。将合并的有机层用水洗涤,然后用盐水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将粗品通过combiflash(硅胶,0-10%甲醇,在环己烷中)纯化,以得到1-[5-乙基硫烷基-1-氧负离子基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-萘啶-6-基]吡啶-1-鎓-3-基]环丙烷甲腈与未反应的1-(5-氟-1-氧负离子基-吡啶-1-鎓-3-基)环丙烷甲腈。LCMS(方法1):Rt=0.98min,m/z=447(M+H)⁺。

[0929] 步骤7:1-[5-乙基硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈(中间体I-14)的制备



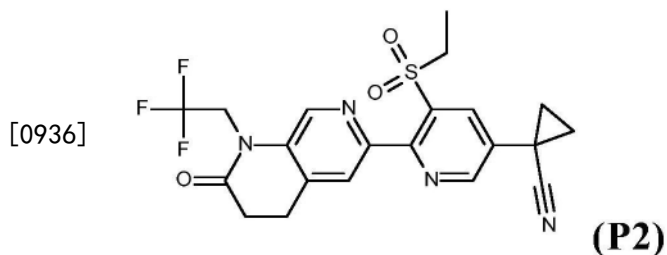
[0931] 向1-[5-乙基硫烷基-1-氧负离子基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-萘啶-6-基]吡啶-1-鎓-3-基]环丙烷甲腈(如上所述制备的中间体I-13,1.769g,3.96mmol)在干乙腈(35.4mL)中的溶液中添加4,4,5,5-四甲基-2-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷-2-基)-1,3,2-二氧杂环戊硼烷(1.509g,5.944mmol)并将反应混合物在70℃下搅拌3小时,最后在70℃下搅拌12小时。将反应物质用水(100mL)稀释并用乙酸乙酯(3x 100mL)萃取。将合并的有机层用盐水(50mL)洗涤,经无水硫酸钠干燥,过滤,并真空浓缩。将粗品通过combiflash(硅胶,0-40%乙酸乙酯,在环己烷中)纯化,以得到呈灰白色固体的1-[5-乙基硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈。LCMS(方法1):Rt=1.09min,m/z=431(M+H)⁺。¹H NMR(400MHz,氯仿-d)δppm 1.38(t,3H)1.52-1.58(m,2H)1.85-1.90(m,2H)2.98(q,2H)5.08(br d,2H)6.95(d,1H)7.71(d,1H)7.81(d,1H)8.24-8.30(m,2H)8.94(s,1H)。

[0932] 步骤8:1-[5-乙基硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈(化合物P6)的制备



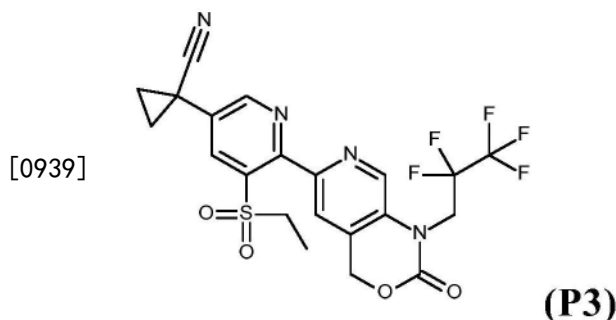
[0934] 向1-[5-乙基硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈(如上所述制备的中间体I-14,0.680g,1.580mmol)在四氢呋喃(13.6mL)中的0℃冷却溶液中添加饱和氯化铵水溶液(6.8mL),随后添加催化量的三氟乙酸(0.018g,0.158mmol)和锌(0.516g,7.90mmol)。将反应混合物在室温下搅拌2.5小时。将反应物质用饱和氯化铵水溶液(50mL)淬灭,并用乙酸乙酯(3x 50mL)萃取。将合并的有机层经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将粗品通过combiflash(硅胶,0-50%乙酸乙酯,在环己烷中)纯化,以得到呈白色固体的纯1-[5-乙基硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈。LCMS(方法3):Rt=1.10min,m/z=433(M+H)⁺。¹H NMR(400MHz,氯仿-d)δppm 1.38(t,3H)1.51-1.56(m,2H)1.84-1.89(m,2H)2.80(dd,2H)2.97(q,2H)3.05-3.11(m,2H)4.73(q,2H)7.68(d,1H)7.95(s,1H)8.25(d,1H)8.52(s,1H)。

[0935] 步骤9:1-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈(化合物P2)的制备

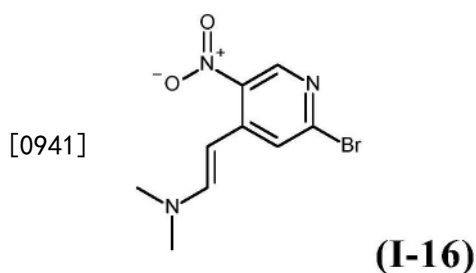


[0937] 向1-[5-乙基磺烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈(如上所述制备的化合物P6,0.370g,0.8555mmol)在乙腈(7.4mL)中的0℃冷却溶液中添加3-氯过氧苯甲酸(0.464g,1.882mmol,70质量%)。将反应物质在0-10℃下搅拌2小时。将反应物质用2N氢氧化钠水溶液(10mL)和水(20mL)淬灭,用乙酸乙酯(3x30mL)萃取。将合并的有机层用盐水(30mL)洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将粗品通过combiflash(硅胶,0-80%乙酸乙酯,在环己烷中)纯化,以得到呈白色固体的纯1-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈。LCMS(方法1):Rt=1.03min,m/z=465(M+H)⁺。¹H NMR(400MHz,氯仿-d)δ ppm 1.41(t,3H)1.60-1.63(m,2H)1.94-1.99(m,2H)2.83(dd,2H)3.07-3.13(m,2H)3.98(q,2H)4.74(q,2H)7.75(s,1H)8.23(d,1H)8.40(s,1H)8.94(d,1H)。

[0938] 实例P3:1-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈(化合物P3)的制备

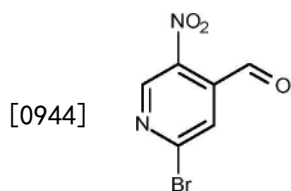


[0940] 步骤1:(E)-2-(2-溴-5-硝基-4-吡啶基)-N,N-二甲基-乙胺(中间体I-16)的制备



[0942] 向2-溴-4-甲基-5-硝基-吡啶(10.0g,43.8mmol)在N,N-二甲基甲酰胺(153mL)中的溶液中添加1,1-二甲氧基-N,N-二甲基甲胺(DMF-DMA,24mL,175mmol),随后通过注射器滴加1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯(0.668mL,4.38mmol)并将反应物质在室温下搅拌过夜。将反应混合物真空浓缩,以得到(E)-2-(2-溴-5-硝基-4-吡啶基)-N,N-二甲基-乙胺。将此材料原样用于下一步骤。LCMS(方法2):Rt=1.42min,m/z=272/274(M+H)⁺。

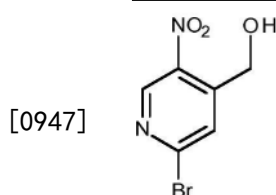
[0943] 步骤2:2-溴-5-硝基-吡啶-4-甲醛(中间体I-17)的制备



(I-17)

[0945] 向(E)-2-(2-溴-5-硝基-4-吡啶基)-N,N-二甲基-乙胺(如上所述制备的中间体I-16, 1.0g, 3.3mmol)在四氢呋喃(10mL)和水(10mL)中的溶液中添加高碘酸钠(2.6g, 12mmol)。将反应混合物在室温下搅拌过夜。完成后,将反应混合物用水淬灭,并将混合物用乙酸乙酯(3x150mL)萃取。将合并的有机层经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩,以得到2-溴-5-硝基-吡啶-4-甲醛。将此材料原样用于下一步骤。¹H NMR (400MHz, 氯仿-d) δ ppm 8.04 (s, 1H) 9.23 (s, 1H) 10.30 (s, 1H)。

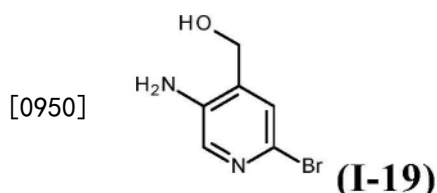
[0946] 步骤3: (2-溴-5-硝基-4-吡啶基)甲醇(中间体I-18)的制备



(I-18)

[0948] 向2-溴-5-硝基-吡啶-4-甲醛(如上所述制备的中间体I-17, 0.500g, 2.056mmol)在甲醇(5mL)中的0℃冷却溶液中分部分地添加硼氢化钠(0.086g, 2.056mmol)并继续搅拌5分钟(在氮气下)。将反应物质用水(30mL)淬灭,并且用乙酸乙酯(2x 30mL)萃取。将合并的有机层经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将粗品通过combi flash(硅胶, 乙酸乙酯, 在环己烷中)纯化,以得到纯(2-溴-5-硝基-4-吡啶基)甲醇。LCMS(方法1): Rt=0.76min, m/z=233/235 (M+H)⁺。

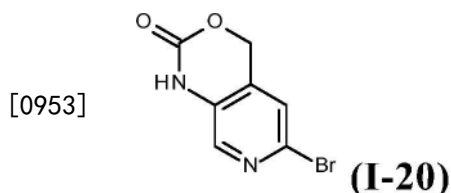
[0949] 步骤4: (5-氨基-2-溴-4-吡啶基)甲醇(中间体I-19)的制备



(I-19)

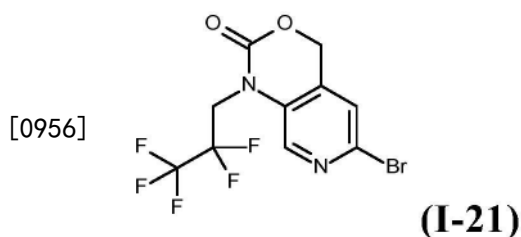
[0951] 向(2-溴-5-硝基-4-吡啶基)甲醇(如上所述制备的中间体I-18, 0.100g, 0.4291mmol)在四氢呋喃(0.9mL)、乙醇(0.9mL)和水(0.3mL)中的溶液中分部分地添加铁(0.126g, 2.1457mmol),随后添加氯化铵(0.035gm, 0.64372mmol)。将反应混合物在95℃下搅拌4小时。将反应混合物冷却至室温,并且然后用乙醇稀释并通过硅藻土过滤,然后将滤液真空浓缩。将获得的残余物溶解于乙酸乙酯中,并用水洗涤,随后用盐水洗涤。将有机层经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩,以得到(5-氨基-2-溴-4-吡啶基)甲醇。将此材料原样用于下一步骤。LCMS(方法1): Rt=0.17min, m/z=203/205 (M+H)⁺。

[0952] 步骤5: 6-溴-1,4-二氢吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(中间体I-20)的制备



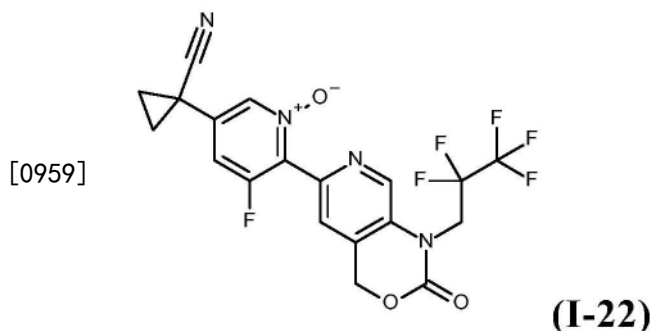
[0954] 向(5-氨基-2-溴-4-吡啶基)甲醇(如上所述制备的中间体I-19, 1.2g, 5.3mmol)在无水1,4-二噁烷(12mL)中的0℃冷却溶液中添加三乙胺(1.5mL, 11mmol), 随后添加双(三氯甲基)碳酸酯(0.81g, 2.7mmol) (一次性, 在氮气下)。将反应混合物在室温下搅拌过夜。将反应物质用冰冷水淬灭并用乙酸乙酯(3x 10mL)萃取。将合并的有机层经硫酸钠干燥并真空浓缩, 以得到呈灰白色固体的6-溴-1,4-二氢吡啶并[3,4-d][1,3]噻嗪-2-酮。LCMS(方法1): Rt=0.22min, m/z=229/231 (M+H)⁺。¹H NMR(400MHz, DMSO-d₆) δppm 5.34-5.37 (m, 2H) 7.54 (s, 1H) 7.92 (s, 1H) 10.53 (s, 1H)。

[0955] 步骤6: 6-溴-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噻嗪-2-酮(中间体I-21)的制备



[0957] 在氮气下, 向6-溴-1,4-二氢吡啶并[3,4-d][1,3]噻嗪-2-酮(如上所述制备的中间体I-20, 2.02g, 8.38mmol)在乙腈(20.2mL)中的0℃冷却溶液中添加碳酸二钾(1.74g, 12.6mmol)。将2,2,3,3,3-五氟丙基三氟甲磺酸酯(4.87g, 16.8mmol)滴加至反应物质中。将反应物质在室温下搅拌过夜。将反应物质用冰冷水淬灭并用乙酸乙酯(3x50mL)萃取。将合并的有机层经硫酸钠干燥并真空浓缩。将粗品通过combiflash(硅胶, 乙酸乙酯, 在环己烷中)纯化, 以得到呈纯奶油色固体的纯6-溴-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噻嗪-2-酮。LCMS(方法1): Rt=1.06min, m/z=361/363 (M+H)⁺。¹H NMR(400MHz, 氯仿-d) δppm 4.64-4.85 (m, 2H) 5.27 (s, 2H) 7.36 (s, 1H) 8.18 (s, 1H)。

[0958] 步骤7: 1-[5-氟-1-氧负离子基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噻嗪-6-基]吡啶-1-鎓-3-基]环丙烷甲腈(中间体I-22)的制备



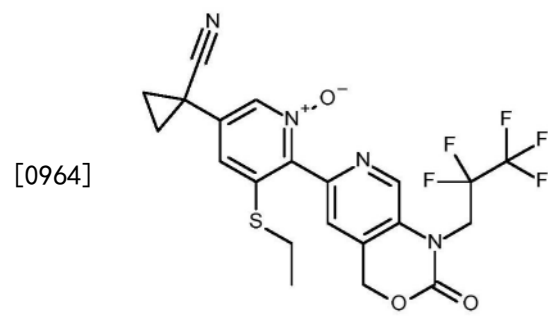
[0960] 将2,2,6,6-四甲基哌啶基氯化锌氯化锂络合物在四氢呋喃(7.6mL, 7.6mmol, 1mol/l)中的溶液滴加至1-(5-氟-1-氧负离子基-吡啶-1-鎓-3-基)环丙烷甲腈(CAS 2489316-32-5, 如WO 2020182577中所述的制备)(1.3g, 7.6mmol)在四氢呋喃(13mL)中的脱

气溶液中(在0℃下,在氮气下)并搅拌15分钟。在10℃下,将6-溴-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(如上所述制备的中间体I-21,2.1g,5.8mmol)在四氢呋喃(21mL)中的脱气溶液添加至反应混合物中。在添加完成后,添加Pd(dppf)Cl₂(0.26g,0.35mmol)并将反应物质在60℃下加热16小时。将反应物质用饱和碳酸氢钠水溶液(30mL)淬灭并用乙酸乙酯(3x)萃取。将合并的有机层用水洗涤,然后用盐水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将粗品通过combiflash(硅胶,65%乙酸乙酯,在环己烷中)纯化,以得到1-[5-氟-1-氧负离子基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]吡啶-1-鎓-3-基]环丙烷甲腈以及未反应的1-(5-氟-1-氧负离子基-吡啶-1-鎓-3-基)环丙烷甲腈。将此材料原样用于下一步骤。LCMS(方法1):Rt=0.99min,m/z=459(M+H)⁺。

[0961] 类似地,6-(3-氟-1-氧负离子基-吡啶-1-鎓-2-基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(中间体I-37)可以由3-氟吡啶N-氧化物(CAS 695-37-4)和6-溴-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(中间体I-21)制备。

[0962] LCMS(方法1):m/z=394(M+H)⁺,Rt 0.92min。

[0963] 步骤8:1-[5-乙基硫烷基-1-氧负离子基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]吡啶-1-鎓-3-基]环丙烷甲腈(中间体I-23)的制备

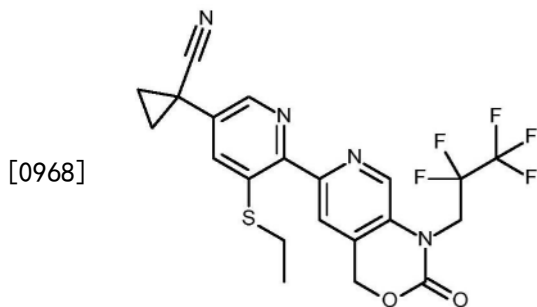


[0965] 在氮气氛下,向1-[5-氟-1-氧负离子基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]吡啶-1-鎓-3-基]环丙烷甲腈(如上所述制备的中间体I-22,0.360g,0.785mmol)在N-甲基-2-吡咯烷酮(7.2mL)中的0℃冷却溶液中添加乙硫醇钠(0.123g,1.178mmol)。将反应混合物在室温下搅拌5小时。通过LCMS监测该反应。LCMS显示部分转化,将另外的乙硫醇钠(0.123g,1.178mmol)添加至反应物质中并在室温下再搅拌16小时。完成后,将反应物质用冰冷水(10mL)淬灭并用乙酸乙酯(3x)萃取。将合并的有机层用水洗涤,然后用盐水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将粗品通过combiflash(硅胶,4%甲醇,在环己烷中)纯化,以得到呈棕色粘稠油状物的纯1-[5-乙基硫烷基-1-氧负离子基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]吡啶-1-鎓-3-基]环丙烷甲腈)。LCMS(方法1):Rt=1.01min,m/z=501(M+H)⁺。

[0966] 类似地,6-(3-乙基硫烷基-1-氧负离子基-吡啶-1-鎓-2-基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(中间体I-38)可以由6-(3-氟-1-氧负离子基-吡啶-1-鎓-2-基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(如上所述制备的中间体I-37)制备。LCMS(方法1):m/z=436(M+H)⁺,Rt 0.96min。

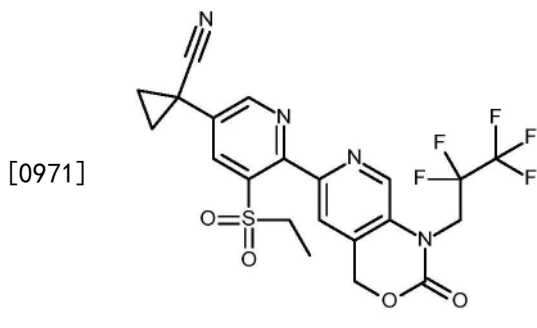
[0967] 步骤9:1-[5-乙基硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-

d] [1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈(化合物P4)的制备



[0969] 向1-[5-乙基硫烷基-1-氧负离子基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]吡啶-1-鎇-3-基]环丙烷甲腈(如上所述制备的中间体I-23, 0.250g, 0.499mmol)在四氢呋喃(5mL)中的0℃冷却溶液中添加饱和氯化铵水溶液(2.5mL), 随后添加锌(0.0980g, 1.499mmol)。将反应混合物在室温下搅拌22小时。将反应物质用水(30mL)淬灭, 并且用乙酸乙酯(3x 30mL)萃取。将合并的有机层经无水硫酸钠干燥, 过滤并真空浓缩。将粗品通过combiflash(硅胶, 55%乙酸乙酯, 在环己烷中)纯化, 以得到呈白色固体的纯1-[5-乙基硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈。LCMS(方法1): Rt=1.13min, m/z=485(M+H)⁺。¹H NMR(400MHz, 氯仿-d) δppm 1.36-1.42(m, 3H) 1.51-1.57(m, 2H) 1.82-1.90(m, 2H) 2.92-3.01(m, 2H) 4.74-4.88(m, 2H) 5.38(s, 2H) 7.70(d, 1H) 7.99(s, 1H) 8.22-8.26(m, 1H) 8.51(s, 1H)。

[0970] 步骤10: 1-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈(化合物P3)的制备

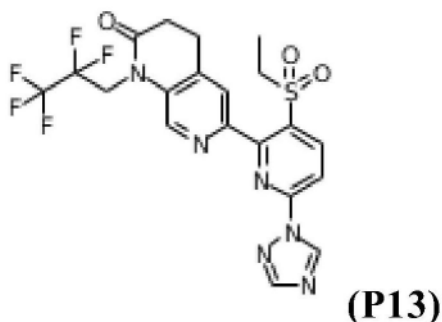


[0972] 向1-[5-乙基硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈(如上所述制备的化合物P4, 0.220g, 0.454mmol)在三氟化苯(5mL)中的0℃冷却溶液中添加3-氯过氧苯甲酸(0.246g, 0.999mmol, 70质量%)。将反应物质在室温下搅拌2小时。将反应物质用2N氢氧化钠水溶液(20mL)和水(10mL)淬灭, 用乙酸乙酯(2x50mL)萃取。将合并的有机层用盐水(20mL)洗涤, 经硫酸钠干燥, 过滤并真空浓缩。将粗品通过combiflash(硅胶, 60%乙酸乙酯, 在环己烷中)纯化, 以得到呈白色固体的纯1-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈。LCMS(方法2): Rt=1.37min, m/z=517(M+H)⁺。¹H NMR(400MHz, 氯仿-d) δppm 1.41(t, 3H) 1.55-1.68(m, 2H) 1.94-2.01(m, 2H) 3.95(q, 2H) 4.75-4.91(m, 2H) 5.39(s, 2H) 7.74(s, 1H) 8.23(d, 1H) 8.39(s, 1H) 8.95(d, 1H)。

[0973] 实例P13: 6-[3-乙基磺酰基-6-(1,2,4-三唑-1-基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五

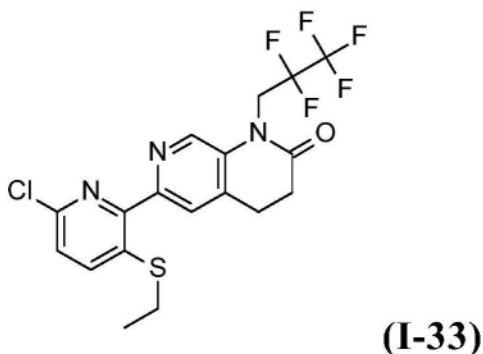
氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(化合物P13)的制备

[0974]



[0975] 步骤1:6-(6-氯-3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(中间体I-33)的制备

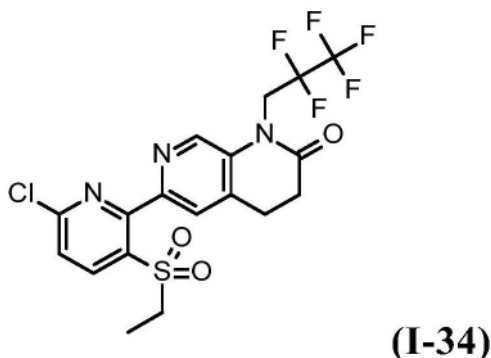
[0976]



[0977] 向0℃下的6-(6-氯-3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-1,7-萘啶-2-酮(如W0 21/136722中所述制备的)(3.3g,5.1mmol,70质量%) 在四氢呋喃(66mL)中的溶液中添加饱和氯化铵水溶液(33mL),最后添加催化量的三氟乙酸(0.059g,0.51mmol)和锌(2.4g,36mmol)。将反应混合物在室温下搅拌2小时,然后用饱和氯化铵水溶液(10mL)淬灭,并将产物用乙酸乙酯(3x 50mL)萃取。将合并的有机层经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将粗品通过combiflash(乙酸乙酯,在环己烷中)纯化,以得到呈白色固体的6-(6-氯-3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(中间体I-33)。LCMS(方法1):Rt=1.19min,m/z=452/454(M+H)⁺。

[0978] 步骤2:6-(6-氯-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(中间体I-34)的制备

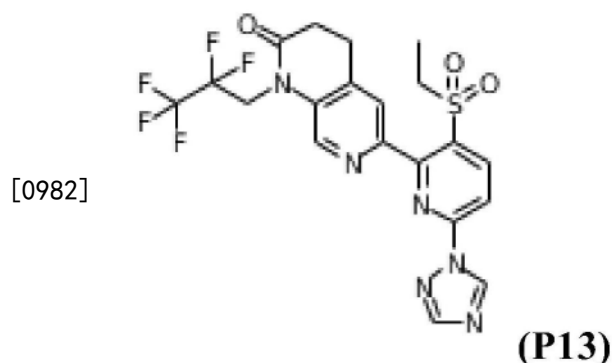
[0979]



[0980] 向0℃下的6-(6-氯-3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(如上所述制备的中间体I-33)(540mg,1.20mmol)在三氟甲基苯(5.4mL)中的溶液中分部分地添加3-氯过氧苯甲酸(648.2mg,2.63mmol,70质量%)。将反应混合物

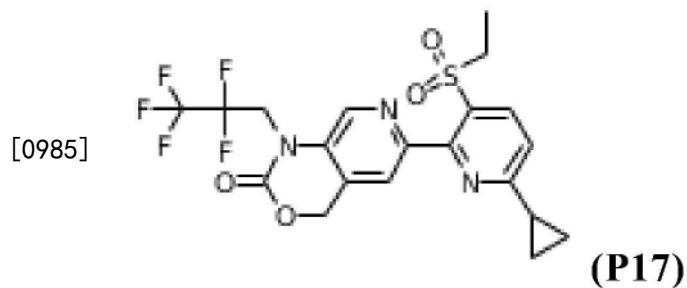
在室温下搅拌1.5小时,然后倒入饱和碳酸氢钠水溶液(80ml)中,并将产物用乙酸乙酯(3x 80mL)萃取。将合并的有机层经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将粗产物通过combiflash(硅胶,30%乙酸乙酯,在环己烷中)纯化,以得到6-(6-氯-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(中间体I-34)。LCMS(方法1):Rt=1.15min,m/z=484/486(M+H)⁺。

[0981] 步骤3:6-[3-乙基磺酰基-6-(1,2,4-三唑-1-基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(化合物P13)的制备

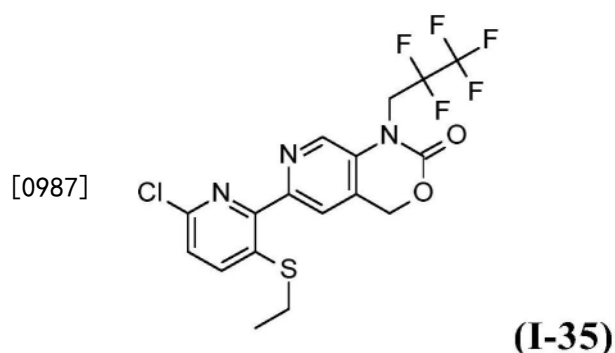


[0983] 向6-(6-氯-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(如上所述制备的中间体I-34)(100mg,0.207mmol)在乙腈(1mL)中的溶液中添加1H-1,2,4-三唑(21.4mg,0.31mmol)和碳酸钾(42.85mg,0.31mmol)。将反应混合物在90℃下搅拌2小时,然后用水稀释。将沉淀的产物滤出,用正戊烷洗涤并干燥,以得到呈固体的6-[3-乙基磺酰基-6-(1,2,4-三唑-1-基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮(化合物P13)。LCMS(方法1):Rt=1.04min,m/z=517(M+H)⁺。

[0984] 实例P17:6-(6-环丙基-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(化合物P17)的制备

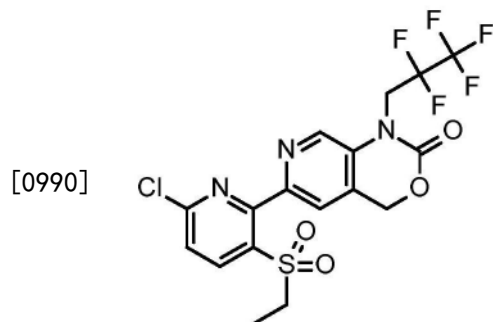


[0986] 步骤1:6-(6-氯-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(中间体I-35)的制备



[0988] 将6-(3-乙基硫烷基-1-氧负离子基-吡啶-1-鎓-2-基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(如上所述制备的中间体I-38)(2.3g,5.3mmol)溶解于磷酸氯(23mL)中。将溶液在室温下搅拌3小时。将反应混合物缓慢倒在冰水上,用水性饱和碳酸氢钠中和,并且将产物用乙酸乙酯(3x20ml)萃取。将合并的有机层经无水硫酸钠干燥、过滤并减压浓缩。粗材料通过combiflash(硅胶,30%-35%乙酸乙酯,在环己烷中)纯化,得到6-(6-氯-3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(中间体I-35)。LCMS(方法1):Rt=1.20min,m/z=454/456(M+H)⁺。

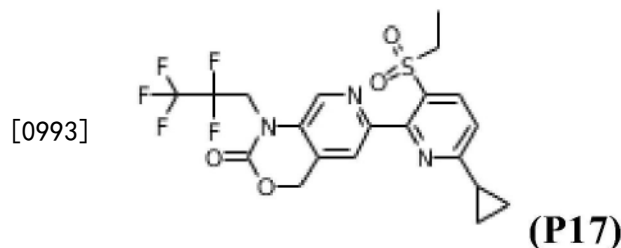
[0989] 步骤2:6-(6-氯-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(中间体I-36)的制备



(I-36)

[0991] 向0℃下的6-(6-氯-3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(如上所述制备的中间体I-35)(800mg,1.76mmol)在三氟甲苯(8mL)中的溶液中分部分地添加3-氯过氧苯甲酸(956mg,3.88mmol,70质量%)。将反应混合物在室温下搅拌1.5小时,然后倒入饱和碳酸氢钠水溶液(50ml)中,并将产物用乙酸乙酯(3x20mL)萃取。将合并的有机层经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将粗产物通过combiflash(硅胶,30%乙酸乙酯,在环己烷中)纯化,以得到6-(6-氯-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(中间体I-36)。LCMS(方法1):Rt=1.12min,m/z=486/488(M+H)⁺。

[0992] 步骤3:6-(6-环丙基-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(化合物P17)的制备



(P17)

[0994] 向6-(6-氯-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(如上所述制备的中间体I-36)(250mg,0.51mmol)在甲苯(5mL)和水(0.75mL)中的溶液中添加碳酸钾(213mg,1.54mmol)和环丙硼酸(140mg,1.54mmol)。将混合物用氮气脱气10分钟,然后添加[1,1'-双(二苯基-膦基)二茂铁]二氯化钪(II)二氯甲烷络合物(22mg,0.026mmol),并将混合物进一步用氮气脱气5分钟。将反应混合物在微波中在110℃下加热1.5小时,用水(10mL)稀释并将产物用乙酸乙酯萃取三次。将合并的有机层用盐水洗涤,经无水硫酸钠干燥,过滤并减压浓缩。将粗材料通过combiflash(硅胶,0-10%甲

醇,在乙酸乙酯中)纯化,得到呈固体的6-(6-环丙基-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮(化合物P17)。LCMS(方法3):Rt=1.14min,m/z=492(M+H)⁺。

[0995] 表P:具有式(I)的化合物的实例

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (测量的)	方法	
P1	6-(3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮		0.97	450	1	172 - 174
P2	1-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈		1.03	465	1	208 - 210
[0996] P3	1-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈		1.37	517	2	208 - 210
P4	1-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈		1.13	485	1	146 - 148
P5	6-[5-(3-氯吡唑-1-基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮		1.17	550/552	3	246 - 247

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (测量的)	方法	
P6	1-[5-乙基硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈		1.10	433	3	180 - 181
P7	N-[5-乙基硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙酰胺		1.05	489	3	162 - 164
[0997] P8	N-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙酰胺		1.01	521	3	214 - 216
P9	6-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮		1.10	518	1	197 - 198
P10	6-[3-乙基磺酰基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮		1.48	520	4	194 - 196

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (测量的)	方法	
P11	2-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]-2-甲基-丙腈		1.11	517	3	206 - 208
P12	1-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲醇		1.08	515	3	188 - 190
[0998] P13	6-[3-乙基磺酰基-6-(1,2,4-三唑-1-基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮		1.04	517	1	268 - 270
P14	6-(6-环丙基-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮		1.13	490	1	178 - 180
P15	2-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]-2-甲基-丙腈		1.15	519	3	200 - 202

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (测量的)	方法	
P16	6-[3-乙基磺酰基-6-(1,2,4-三唑-1-基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮		1.06	519	3	262 - 264
P17	6-(6-环丙基-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮		1.14	492	3	222 - 225
P18	N-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙酰胺		1.06	523	3	250 - 252
P19	6-(5-环丙基-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮		1.08	490	1	205 - 206
P20	2-[[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-6-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈		1.13	533	3	177 - 178

[0999]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (测量的)	方法	
P21	6-[3-乙基磺酰基-5-(2-吡啶基氧基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮		1.12	543	3	194 - 196
P22	6-(3-乙基磺酰基-6-嘧啶-2-基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮		1.02	528	1	226 - 228
P23	6-[3-乙基磺酰基-5-(1-氟-1-甲基-乙基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮		1.48	510	4	198 - 200
P24	6-[5-(2,2-二氟丙氧基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮		1.50	544	4	162 - 164
P25	6-[5-(2,2-二氟丙氧基)-3-乙基硫烷基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮		1.53	512	4	122 - 124

[1000]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (测量的)	方法	
P26	6-[3-乙基硫烷基-5-(三氟甲基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4 <i>H</i> -吡啶并[3,4- <i>d</i>][1,3]噁嗪-2-酮		1.27	488	3	168 - 170
P27	6-[5-(2,2-二氟丙氧基)-3-乙基硫烷基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4 <i>H</i> -吡啶并[3,4- <i>d</i>][1,3]噁嗪-2-酮		1.17	514	3	158 - 160
P28	6-[3-乙基硫烷基-5-(甲基氨基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4 <i>H</i> -吡啶并[3,4- <i>d</i>][1,3]噁嗪-2-酮		1.09	449	3	212 - 214
P29	<i>N</i> -[5-乙基硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4 <i>H</i> -吡啶并[3,4- <i>d</i>][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]- <i>N</i> -甲基-乙酰胺		1.07	491	3	154 - 156
P30	6-[3-乙基磺酰基-5-(1-氟-1-甲基-乙基)-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4 <i>H</i> -吡啶并[3,4- <i>d</i>][1,3]噁嗪-2-酮		1.13	512	3	192 - 194

[1001]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (测量的)	方法	
P31	6-[5-(2,2-二氟丙氧基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮		1.13	546	3	198 - 200
P32	6-[5-(2,2-二氟丙氧基)-3-乙基亚磺酰基-2-吡啶基]-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮		1.21	530	3	158 - 160
P33	2-[5-乙基硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]-2-甲基-丙腈		1.22	487	1	174 - 176
P34	1-[5-乙基磺酰基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈		1.05	467	3	218 - 220
P35	1-[5-乙基硫烷基-6-[2-氧代-1-(2,2,2-三氟乙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-6-基]-3-吡啶基]环丙烷甲腈		1.11	435	3	186 - 188

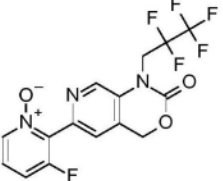
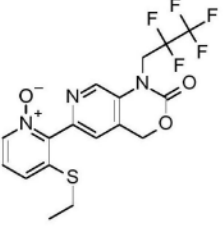
[1003] 表I: 中间体的实例

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (测量的)	方法	
I-24	(3-氟吡唑-1-基)-5-氟-1-氧负离子基-吡啶-1-鎓		0.67	214/216	1	-
I-25	3-氟-1-氧负离子基-5-(三氟甲基)吡啶-1-鎓		0.52	182	3	-
I-26	2-(5-氟-1-氧负离子基-吡啶-1-鎓-3-基)氧基-2-甲基-丙腈		0.21	197	3	-
I-27	2-[(5-氟-3-吡啶基)氧基]-2-甲基-丙腈		0.98	181	3	-
I-28	3-氟-5-(1-氟-1-甲基-乙基)-1-氧负离子基-吡啶-1-鎓		0.49	174	4	-
I-29	3-氟-5-(1-氟-1-甲基-乙基)吡啶		1.20	158	4	-
I-30	3-(2,2-二氟丙氧基)-5-氟-1-氧负离子基-吡啶-1-鎓		0.37	208	1	-

[1004]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (测量的)	方法	
I-31	3-(2,2-二氟丙氧基)-5-氟-吡啶		1.10	192	3	-
I-32	6-溴-1-(2,2,2-三氟乙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮		1.04	311/313	3	-
I-33	6-(6-氯-3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮		1.19	452/454	1	-
I-34	6-(6-氯-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-3,4-二氢-1,7-萘啶-2-酮		1.15	484/486	1	-
I-35	6-(6-氯-3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮		1.20	454/456	1	-
I-36	6-(6-氯-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮		1.12	486/488	1	-

[1005]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (测量的)	方法	
[1006] I-37	6-(3-氟-1-氧负离子基-吡啶-1-鎓-2-基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮		0.92	394	1	-
I-38	6-(3-乙基硫烷基-1-氧负离子基-吡啶-1-鎓-2-基)-1-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4H-吡啶并[3,4-d][1,3]噁嗪-2-酮		0.96	436	1	-

[1007] 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描述为协同活性。例如,植物的更好的耐受性、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,在它们的储存期间或它们的使用期间)的更好的行为。

[1008] 在这里,适合添加的活性成分是例如以下类别的活性成分的代表:有机磷化合物、硝基苯酚衍生物、硫脲、保幼激素、甲脒、二苯甲酮衍生物、脲类、吡咯衍生物、氨基甲酸酯、拟除虫菊酯、氯化烃、酰基脲、吡啶基亚甲基氨基衍生物、大环内酯类、新烟碱以及苏芸金芽孢杆菌制剂。

[1009] 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”意指“选自由以下组成的组的一种化合物:描述于本发明的表A-1至A-60、表B-1至B-60、表C-1至C-60和表D-1至D-60和表P中的化合物”):

[1010] 辅助剂,其选自由以下组成的物质组:石油(别名)(628)+TX;

[1011] 阿维菌素+TX、灭螨醌+TX、啉虫脒+TX、乙酰虫腈+TX、氟丙菊酯+TX、阿西诺阿皮(acynonapyr)+TX、双丙环虫酯+TX、阿福拉纳(afoxolaner)+TX、棉铃威+TX、丙烯除虫菊酯+TX、 α -氯氰菊酯+TX、甲体氯氰菊酯+TX、磺胺螨酯+TX、灭害威+TX、三唑锡+TX、杀虫磺+TX、苯螨特+TX、苯吡莫烷(benzpyrimoxan)+TX、 β -氟氯氰菊酯+TX、 β -氯氰菊酯+TX、联苯肼酯+TX、联苯菊酯+TX、乐杀螨+TX、生物烯丙菊酯+TX、S-生物烯丙菊酯+TX、生物苜蓿菊酯+TX、双三

氟虫脲+TX、溴虫氟苯双酰胺(broflanilide)+TX、溴氟菊酯+TX、溴硫磷-乙基+TX、噻嗪酮+TX、丁酮威+TX、硫线磷+TX、西维因+TX、丁硫克百威+TX、巴丹+TX、CAS号:1632218-00-8+TX、CAS号:1808115-49-2+TX、CAS号:2032403-97-5+TX、CAS号:2044701-44-0+TX、CAS号:2128706-05-6+TX、CAS号:2095470-94-1+TX、CAS号:2377084-09-6+TX、CAS号:1445683-71-5+TX、CAS号:2408220-94-8+TX、CAS号:2408220-91-5+TX、CAS号:1365070-72-9+TX、CAS号:2171099-09-3+TX、CAS号:2396747-83-2+TX、CAS号:2133042-31-4+TX、CAS号:2133042-44-9+TX、CAS号:1445684-82-1+TX、CAS号:1445684-82-1+TX、CAS号:1922957-45-6+TX、CAS号:1922957-46-7+TX、CAS号:1922957-47-8+TX、CAS号:1922957-48-9+TX、CAS号:2415706-16-8+TX、CAS号:1594624-87-9+TX、CAS号:1594637-65-6+TX、CAS号:1594626-19-3+TX、CAS号:1990457-52-7+TX、CAS号:1990457-55-0+TX、CAS号:1990457-57-2+TX、CAS号:1990457-77-6+TX、CAS号:1990457-66-3+TX、CAS号:1990457-85-6+TX、CAS号:2220132-55-6+TX、CAS号:1255091-74-7+TX、CAS号:1305319-70-3+TX、CAS号:1442448-92-1+TX、氯虫苯甲酰胺+TX、氯丹+TX、溴虫腈+TX、氯炔丙菊酯+TX、环虫酰胺+TX、克仑吡林+TX、除线威(cloethocarb)+TX、噻虫胺+TX、2-氯苯基N-甲基氨基甲酸酯(CPMC)+TX、苯腈磷+TX、溴氰虫酰胺+TX、环溴虫酰胺+TX、环丁氟仑(cyclobutrifluram)+TX、拟除虫菊酯+TX、环氧虫啉+TX、腈吡蚜酮+TX、乙唑蚜酮(cyetyprafen或etpyrafen)+TX、丁氟蚜酮+TX、氟氯氰菊酯+TX、氯氟氰虫酰胺(cyhalodiamide)+TX、三氟氯氰菊酯+TX、氯氰菊酯+TX、苯氰菊酯+TX、环丙氟虫胺(cyproflanilide)+TX、灭蝇胺+TX、溴氰菊酯+TX、杀蚜隆+TX、氯亚胺硫磷+TX、二溴磷(dibrom)+TX、二氯噻吡啶(dicloromezotiaz)+TX、氟蚜啉+TX、除虫脲+TX、噻虫啉酰胺(dimpropridaz)+TX、二活菌素+TX、敌蚜普+TX、呋虫胺+TX、蔬果磷+TX、埃玛菌素(或埃玛菌素苯甲酸盐)+TX、右旋烯炔菊酯+TX、ε-莫氟菊酯(epsilon-momfluorothrin)+TX、ε-甲氧苄氟菊酯+TX、高氰戊菊酯+TX、乙硫磷+TX、乙虫腈+TX、醚菊酯+TX、乙蚜啉+TX、伐灭磷+TX、啶蚜酮+TX、五氟苯菊酯+TX、丰迷啉迪缇亚兹(fenmezoditiaz)+TX、杀螟硫磷+TX、仲丁威+TX、苯硫威+TX、苯氧威+TX、甲氰菊酯+TX、啉蚜酮(fenpyroximate)+TX、丰索磷+TX、倍硫磷+TX、叶塞灵+TX、氰戊菊酯+TX、氟虫腈+TX、氟麦托醌(flometoquin)+TX、氟啉虫酰胺+TX、啉蚜酮+TX、三氟咪啉酰胺(fluzaindolizine)+TX、啉蚜脲+TX、氟虫双酰胺+TX、氟蚜啉+TX、氟氯虫双酰胺(fluchlordiniliprole)+TX、氟西特纳特(flucitrinate)+TX、氟蚜脲+TX、氟氰戊菊酯+TX、氟噻虫砒+TX、啉蚜胺+TX、三氟醚菊酯+TX、丁烯氟虫腈+TX、氟己芬(fluhexafon)+TX、氟氯苯菊酯+TX、氟吡啉酰胺+TX、氟苯硫奥芬诺克斯(flupentiofenox)+TX、氟吡啉酮+TX、氟吡明(flupyrimin)+TX、氟雷拉纳(fluralaner)+TX、氟胺氰菊酯+TX、氟艾米特米德(fluxametamide)+TX、噻啉膦+TX、γ-三氟氯氰菊酯+TX、GossypureTM+TX、戊吡虫脲+TX、氯虫酰胺+TX、苄蚜啉+TX、七氟甲醚菊酯(heptafluthrin)+TX、噻啉膦+TX、氟蚁脲+TX、咪啉环磷(imicyafos)+TX、吡虫啉+TX、炔啉菊酯+TX、吲达扎吡罗萨米特(indazapyroxamet)+TX、茚虫威+TX、碘甲烷+TX、异菌脲+TX、异噻啉虫酰胺(isocycloseram)+TX、异拌磷+TX、伊维菌素+TX、κ-联苯菊酯+TX、κ-七氟菊酯+TX、λ-三氟氯氰菊酯+TX、雷皮菌素+TX、洛替拉纳(lotilaner)+TX、氯芬奴隆+TX、氰氟虫脲+TX、四聚乙醛+TX、威百亩+TX、灭多虫+TX、甲氧虫酰胺+TX、甲氧苄氟菊酯+TX、速灭威+TX、自克威+TX、灭蚜菌素+TX、莫氟菊酯(momfluorothrin)+TX、灭绦灵+TX、尼克氟普罗(nicofluprole)+TX; 烯啉虫胺+TX、硝虫噻啉+TX、氧乐果+TX、杀线威+TX、oxazosulfonyl+TX、对硫磷-乙基+TX、苄

氯菊酯+TX、苯醚菊酯+TX、磷虫威+TX、胡椒基丁醚+TX、抗蚜威+TX、嘧啶磷-乙基+TX、嘧啶磷-甲基+TX、多角体病毒+TX、炔丙菊酯+TX、丙溴磷+TX、丙氟菊酯+TX、克螨特+TX、胺丙畏+TX、残杀威+TX、丙硫磷+TX、丙苯炔菊酯(protrifenbute)+TX、吡氟丁酰胺(pyflubumide)+TX、吡蚜酮+TX、吡唑硫磷+TX、啉吡啉虫胺(pyrafluprole)+TX、哒螨灵+TX、啉虫丙醚+TX、氟虫吡啶(pyrifluquinazon)+TX、嘧螨醚+TX、嘧螨胺+TX、吡啉虫啉+TX、蚊蝇醚+TX、苜蓿菊脂+TX、沙洛拉那+TX、司拉克丁(selamectin)+TX、氟硅菊酯+TX、乙基多杀菌素+TX、多杀菌素+TX、螺螨酯+TX、螺甲螨酯+TX、spiropidion+TX、螺虫乙酯+TX、spidoxamat+TX、虱虫啉+TX、虫酰肼+TX、吡螨胺+TX、丁基嘧啶磷(tebupirimiphos)+TX、七氟菊酯+TX、双硫磷+TX、四氯虫酰胺+TX、四氯杀螨啉(tetradiphon)+TX、胺菊酯+TX、四氟醚菊酯+TX、杀螨素+TX、氟氰虫酰胺+TX、 θ -氯氰菊酯+TX、噻虫啉+TX、噻虫嗪+TX、杀虫环+TX、硫双威+TX、久效威+TX、甲基乙拌磷+TX、杀虫单+TX、tigolaner+TX、tioazafen+TX、啉虫酰胺+TX、毒杀芬+TX、四溴菊酯+TX、四氟苯菊酯+TX、啉蚜威+TX、三唑磷+TX、敌百虫+TX、毒壤磷+TX、敌百虫+TX、三氟杀线酯(trifluenfurionate)+TX、三氟苯嘧啶(triflumezopyrim)+TX、Tyclopyrazoflor+TX、 ζ -氯氰菊酯+TX、海藻提取物和衍生自糖酰的发酵产物+TX、海藻提取物和衍生自糖酰的发酵产物(包含脲+TX、氨基酸+TX、钾和钼以及EDTA螯合锰)+TX、海藻提取物和发酵的植物产物+TX、海藻提取物和发酵的植物产物(包含植物激素+TX、维生素+TX、EDTA螯合铜+TX、锌+TX、以及铁+TX)、印楝素+TX、芽孢杆菌属鮎泽(*Bacillus aizawai*)+TX、蚀几丁质芽孢杆菌(*Bacillus chitinosporus*)AQ746(NRRL登记号B-21 618)+TX、坚强芽孢杆菌+TX、芽孢杆菌属库尔斯塔克(*Bacillus kurstaki*)+TX、蕈状芽孢杆菌AQ726(NRRL登记号B-21664)+TX、短小芽孢杆菌(NRRL登记号B-30087)+TX、短小芽孢杆菌AQ717(NRRL登记号B-21662)+TX、芽孢杆菌属物种AQ178(ATCC登记号53522)+TX、芽孢杆菌属物种AQ175(ATCC登记号55608)+TX、芽孢杆菌属物种AQ177(ATCC登记号55609)+TX、未指明的枯草芽孢杆菌+TX、枯草芽孢杆菌AQ153(ATCC登记号55614)+TX、枯草芽孢杆菌AQ30002(NRRL登记号B-50421)+TX、枯草芽孢杆菌AQ30004(NRRL登记号B-50455)+TX、枯草芽孢杆菌AQ713(NRRL登记号B-21661)+TX、枯草芽孢杆菌AQ743(NRRL登记号B-21665)+TX、苏云金芽孢杆菌AQ52(NRRL登记号B-21619)+TX、苏云金芽孢杆菌BD#32(NRRL登记号B-21530)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(subspec.kurstaki)BMP 123+TX、球孢白僵菌+TX、D-柠檬烯+TX、颗粒体病毒+TX、康壮素(Harpin)+TX、棉铃虫核型多角体病毒+TX、谷实夜蛾核型多角体病毒+TX、烟芽夜蛾核型多角体病毒+TX、澳洲棉铃虫核型多角体病毒+TX、绿僵菌属物种+TX、*Muscodor albus* 620(NRRL登记号30547)+TX、*Muscodor roseus* A3-5(NRRL登记号30548)+TX、基于印楝树的产品+TX、玫烟色拟青霉+TX、淡紫色拟青霉+TX、拟斯扎瓦巴氏杆菌+TX、穿刺巴氏杆菌+TX、分枝巴氏杆菌+TX、索雷巴氏杆菌(*Pasteuria thornei*)+TX、巴氏杆菌+TX、对-伞花烃+TX、小菜蛾颗粒体病毒+TX、小菜蛾核型多角体病毒+TX、多角体病毒+TX、除虫菊+TX、QRD 420(类萜共混物)+TX、QRD 452(类萜共混物)+TX、QRD 460(类萜共混物)+TX、皂树+TX、球状红球菌AQ719(NRRL登记号B-21663)+TX、草地贪夜蛾核型多角体病毒+TX、鲜黄链霉菌(NRRL登记号30232)+TX、链霉菌属物种(NRRL登记号B-30145)+TX、类萜共混物+TX、以及轮枝孢属物种+TX;

[1012] 杀藻剂,其选自由以下组成的物质组:百杀辛(bethoxazin)[CCN]+TX、二辛酸铜(IUPAC名称)(170)+TX、硫酸铜(172)+TX、cybutryne[CCN]+TX、二氯萘醌(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、醌苜胺(quinonamid) (1379)+TX、西玛津(730)+TX、三苯基乙酸锡(IUPAC名称) (347)和三苯基氢氧化锡(IUPAC名称) (347)+TX;

[1013] 驱蠕虫剂,其选自由以下组成的物质组:阿维菌素(1)+TX、克芦磷酯(1011)+TX、环丁氟仑+TX、多拉克汀(别名)[CCN]+TX、埃玛菌素(291)+TX、埃玛菌素苯甲酸酯(291)+TX、依立诺克丁(别名)[CCN]+TX、伊维菌素(别名)[CCN]+TX、米尔贝肟(milbemycin oxime)(别名)[CCN]+TX、莫昔克丁(别名)[CCN]+TX、哌嗪[CCN]+TX、司拉克丁(别名)[CCN]+TX、多杀菌素(737)和托布津(thiophanate) (1435)+TX;

[1014] 杀鸟剂,其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)和士的宁(745)+TX;

[1015] 杀细菌剂,其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-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)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、噻菌灵(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;

[1016] 生物试剂,其选自由以下组成的物质组:棉褐带卷蛾GV(别名) (12)+TX、放射形土壤杆菌(别名) (13)+TX、钝绥螨属物种(Amblyseius spp.) (别名) (19)+TX、芹菜夜蛾NPV(别名) (28)+TX、原樱翅小蜂(*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NPV(别名) (38)+TX、坚强芽孢杆菌(*Bacillus firmus*) (别名) (48)+TX、球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus* Neide) (学名) (49)+TX、苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis* Berliner) (学名) (51)+TX、苏云金芽孢杆菌鮎泽亚种(*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、普通草蛉(*Chrysoperla carnea*) (别名) (151)+TX、孟氏隐唇瓢虫(*Cryptolaemus montrouzieri*) (别名) (178)+TX、苹果蠹蛾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、谷实夜蛾NPV(别名) (431)+TX、嗜菌异小杆线虫(*Heterorhabditis bacteriophora*)和大异小杆线虫(*H.megidis*) (别名) (433)+TX、斑长足瓢虫(*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、欧洲新松叶蜂(*Neodiprion sertifer*) NPV和红头新松叶蜂(*N. lecontei*) NPV(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、智利小植绥螨(*Phytoseiulus persimilis*) (别名) (644)+TX、甜菜夜蛾核多角体病毒(*Spodoptera exigua multicapsid nuclear polyhedrosis virus*) (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 riobravis* (别名) (742)+TX、螻蛄斯氏线虫(*Steinernema scapterisci*) (别名) (742)+TX、斯氏线虫属物种(*Steinernema* spp.) (别名) (742)+TX、赤眼蜂属物种(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;

[1017] 土壤消毒剂,其选自由以下组成的物质组:碘甲烷(IUPAC名称) (542)和溴甲烷(537)+TX;

[1018] 化学不育剂,其选自由以下组成的物质组:唑磷嗪(apholate) [CCN]+TX、双(氮丙啶)甲氨基磷硫化物(bisazir) (别名) [CCN]+TX、白消安(别名) [CCN]+TX、除虫脲(250)+TX、迪麦替夫(dimatif) (别名) [CCN]+TX、六甲蜜胺(hemel) [CCN]+TX、六甲磷(hempa) [CCN]+TX、甲基涕巴(metepa) [CCN]+TX、甲硫涕巴(methiotepa) [CCN]+TX、甲基唑磷嗪(methyl apholate) [CCN]+TX、不孕啶(morzid) [CCN]+TX、氟幼脲(penfluron) (别名) [CCN]+TX、涕巴(tepa) [CCN]+TX、硫代六甲磷(thiohempa) (别名) [CCN]+TX、硫涕巴(别名) [CCN]+TX、曲他胺(别名) [CCN]和尿烷亚胺(别名) [CCN]+TX;

[1019] 昆虫信息素,其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、 α -多纹素(α -multistriatin) (别名) [CCN]+TX、西部松小蠹集合信息素(brevicommin) (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、己诱剂(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、三甲基二氧三环壬烷(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、椰蛀犀金龟聚集信息素(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、地中海实蝇引诱剂(839)+TX、地中海实蝇引诱剂A(别名)(839)+TX、地中海实蝇引诱剂B₁(别名)(839)+TX、地中海实蝇引诱剂B₂(别名)(839)+TX、地中海实蝇引诱剂C(别名)(839)和trunc-call(别名)[CCN]+TX;

[1020] 昆虫驱避剂,其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、驱蚊灵(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、草氨酸盐(oxamate)[CCN]和派卡瑞丁[CCN]+TX;

[1021] 杀软体动物剂,其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、磷酸钙[CCN]+TX、除线威(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(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、蜗螺杀(trifenmorph)(1454)+TX、混杀威(trimethacarb)(840)+TX、三苯基乙酸锡(IUPAC名称)(347)和三苯基氢氧化锡(IUPAC名称)(347)+TX、吡啉虫啉(pyriprole)[394730-71-3]+TX;

[1022] 杀线虫剂,其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-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、乙酰虫腈[CCN]+TX、棉铃威(15)+TX、涕灭威(aldicarb)(16)+TX、涕灭砒威(863)+TX、AZ 60541(化合物代码)+TX、苯氯噻(benclothiaz)[CCN]+TX、苯菌灵(62)+TX、丁基哒螨灵(别名)+TX、克线丹(109)+TX、克百威

(carbofuran) (118)+TX、二硫化碳(945)+TX、丁硫克百威(119)+TX、氯化苦(141)+TX、毒死蜱(145)+TX、除线威(999)+TX、环丁氟仑+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、多拉克汀(别名)[CCN]+TX、埃玛菌素(291)+TX、埃玛菌素苯甲酸酯(291)+TX、依立诺克丁(别名)[CCN]+TX、灭线磷(312)+TX、二溴乙烷(316)+TX、苯线磷(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(研究代码)(423)+TX、速杀硫磷[CCN]+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、异酰胺磷(isamidofos)(1230)+TX、氯唑磷(1231)+TX、伊维菌素(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、溴甲烷(537)+TX、异硫氰酸甲酯(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、杀线威(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、噻吩诺(thiafenox)(别名)+TX、虫线磷(1434)+TX、三唑磷(820)+TX、唑蚜威(triazuron)(别名)+TX、二甲苯酚[CCN]+TX、YI-5302(化合物代码)和玉米素(别名)(210)+TX、氟噻虫砜(fluensulfone)[318290-98-1]+TX、氟吡菌酰胺+TX;

[1023] 硝化抑制剂,其选自由以下组成的物质组:乙基黄原酸钾[CCN]以及氯啶(nitrapyrin)(580)+TX;

[1024] 植物活化剂,其选自由以下组成的物质组:阿拉酸式苯(acibenzolar)(6)+TX、阿拉酸式苯-S-甲基(6)+TX、噻菌灵(probenazole)(658)和大虎杖(*Reynoutria sachalinensis*)提取物(别名)(720)+TX;

[1025] 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-(啉啉-2-基氨基)苯磺酰胺(IUPAC名称)(748)+TX、 α -氯代醇[CCN]+TX、磷化铝(640)+TX、安妥(880)+TX、三氧化二砷(882)+TX、碳酸钡(891)+TX、双鼠脲(912)+TX、溴鼠隆(89)+TX、溴敌隆(包括 α -溴敌隆)+TX、溴鼠胺(92)+TX、氰化钙(444)+TX、氯醛糖(127)+TX、氯鼠酮(140)+TX、胆钙化醇(别名)(850)+TX、氯灭鼠灵(1004)+TX、克灭鼠(1005)+TX、杀鼠萘(175)+TX、杀鼠啉啶(1009)+TX、鼠得克(246)+TX、噻鼠灵(249)+TX、敌鼠(273)+TX、钙化醇(301)+TX、氟鼠灵(357)+TX、氟乙酰胺(379)+TX、氟鼠啶(1183)+TX、氟鼠啶盐酸盐(1183)+TX、 γ -HCH(430)+TX、HCH(430)+TX、氰化氢(444)+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、林丹(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;

[1026] 增效剂,其选自由以下组成的物质组:2-(2-丁氧基乙氧基)乙基胡椒酸酯(IUPAC名称)(934)+TX、5-(1,3-苯并间二氧杂环戊烯-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;

[1027] 动物驱避剂,其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、双胍辛盐(guazatine) (422)+TX、双胍辛乙酸盐(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;

[1028] 杀病毒剂,其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;

[1029] 创伤保护剂,其选自由以下组成的物质组:氧化汞(512)+TX、辛噻酮(octhilinone) (590)和甲基托布津(802)+TX;

[1030] 生物活性物质,该生物活性物质选自1,1-双(4-氯苯基)-2-乙氧基乙醇+TX、2,4-二氯苯基苯磺酸盐+TX、2-氟-N-甲基-N-1-萘乙酰胺+TX、4-氯苯基苯基砷+TX、乙酰虫脲+TX、氧涕灭威+TX、赛果+TX、果满磷+TX、胺吸磷+TX、胺吸磷草酸氢盐+TX、双甲脞+TX、杀螨特+TX、氧化砷+TX、偶氮苯+TX、偶氮磷盐+TX、苯菌灵+TX、苯噁磷(benoxa-fos)+TX、苯甲酸苄酯+TX、联苯吡菌胺+TX、溴灭菊酯+TX、溴烯杀+TX、溴硫磷+TX、溴螨酯+TX、噻嗪酮+TX、丁酮威+TX、丁酮砷威+TX、丁基哒螨灵+TX、多硫化钙+TX、毒杀芬+TX、氯灭杀威+TX、卡波硫磷+TX、螨婢胺+TX、灭螨猛+TX、氯杀螨+TX、杀虫脞+TX、杀虫脞盐酸化物+TX、杀螨醇+TX、杀螨酯+TX、敌螨特+TX、乙酯杀螨醇+TX、灭螨脞(chloromebuform)+TX、灭虫隆(chloromethiuron)+TX、丙酯杀螨醇(chloropropylate)+TX、虫螨磷+TX、瓜菊酯I+TX、瓜菊酯II+TX、瓜菊酯+TX、克罗散泰+TX、蝇毒磷+TX、克罗米通+TX、克罗氧磷+TX、硫杂灵+TX、果虫磷+TX、DCPM+TX、DDT+TX、田乐磷+TX、田乐磷-0+TX、田乐磷-S+TX、甲基内吸磷+TX、内吸磷-0+TX、内吸磷-0-甲基+TX、内吸磷-S+TX、内吸磷-S-甲基+TX、内吸磷-S-甲基砷+TX、苯氟磺胺+TX、敌敌畏+TX、二克磷(dicliphos)+TX、除螨灵+TX、甲氟磷+TX、消螨酚(dinex)+TX、消螨酚(dinex-diclexine)+TX、敌螨普-4+TX、敌螨普-6+TX、邻敌螨消+TX、硝戊酯(dinopenton)+TX、硝辛酯(dinosulfon)+TX、硝丁酯(dinoterbon)+TX、敌噁磷+TX、二苯基砷+TX、双硫仑+TX、DNOC+TX、苯氧炔螨(dofenapyn)+TX、多拉菌素+TX、因毒磷+TX、依普菌素+TX、益果(ethoate-methyl)+TX、乙噻硫磷+TX、抗螨唑+TX、苯丁锡(fenbutatin oxide)+TX、苯硫威+TX、吡螨胺(fenpyrad)+TX、唑螨酯+TX、胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)+TX、芬螨酯+TX、氟硝二苯胺(fentrifanil)+TX、氟螨噻+TX、氟螨脲+TX、联氟螨+TX、氟杀螨+TX、FMC 1137+TX、伐虫脞+TX、伐虫脞盐酸化物+TX、胺甲威(formparanate)+TX、 γ -HCH+TX、果绿啉+TX、苜蓿醚+TX、环丙烷甲酸十六烷基酯+TX、水胺硫磷+TX、茉莉菊素I+TX、茉莉菊素II+TX、碘硫磷+TX、林丹+TX、丙螨氰+TX、灭蚜磷+TX、地安磷+TX、甲硫芬+TX、虫螨畏+TX、甲基溴+TX、速灭威+TX、兹科威+TX、米尔贝肟(milbemycin oxime)+TX、丙胺氟磷+TX、久效磷+TX、茂果+TX、莫西菌素+TX、二溴磷+TX、4-氯-2-(2-氯-2-甲基-丙基)-5-[(6-碘-3-吡啶基)甲氧基]哒嗪-3-酮+TX、氟蚁灵+TX、尼可霉素+TX、腈叉威(nitrilacarb)+TX、腈叉威1:1氯化锌配合物+TX、氧化乐果+TX、异亚砷磷(oxydeprofos)+TX、砷拌磷+TX、pp'-DDT+TX、对硫磷+TX、苜蓿菊酯+TX、芬硫磷+TX、伏杀硫磷+TX、硫环磷+TX、磷胺+TX、聚氯萜烯(polychloroterpenes)+TX、浏阳霉素(polynactins)+TX、氯丙醇+TX、蜚虱威+TX、残杀威+TX、乙噻唑磷+TX、发果(prothoate)+TX、除虫菊酯I+TX、除虫菊酯II+TX、除虫菊酯+TX、哒嗪硫磷+TX、噻硫磷(pyrimitate)+TX、

啶硫磷+TX、啶硫磷+TX、R-1492+TX、甘氨硫磷+TX、鱼藤酮+TX、八甲磷+TX、克线丹(sebufos)+TX、西拉菌素+TX、苏果(sophamide)+TX、SSI-121+TX、舒非仑+TX、氟虫胺+TX、治螟磷+TX、硫+TX、氟螨嗪+TX、 τ -氟胺氰菊酯+TX、TEPP+TX、叔丁威+TX、四氯杀螨砒+TX、杀螨好+TX、thiafenox+TX、抗虫威+TX、久效威+TX、甲基乙拌磷+TX、克杀螨+TX、苏云金素(thuringiensin)+TX、威菌磷+TX、苯螨嗪+TX、三唑磷+TX、灭蚜唑(triazuron)+TX、三氯丙氧磷+TX、三活菌素+TX、蚜灭磷+TX、甲烯氟虫腈(vaniliprole)+TX、百杀辛(bethoxazin)+TX、二辛酸铜+TX、硫酸铜+TX、环丁腈(cybutryne)+TX、二氯萘醌+TX、二氯芬+TX、茵多酸+TX、三苯锡(fentin)+TX、熟石灰+TX、代森钠+TX、灭藻醌+TX、醌苈胺+TX、西玛嗪+TX、三苯基乙酸锡+TX、三苯基氢氧化锡+TX、育畜磷+TX、哌嗪+TX、甲基硫菌灵+TX、氯醛糖+TX、倍硫磷+TX、吡啶-4-胺+TX、毒鼠碱+TX、1-羟基-1H-吡啶-2-硫酮+TX、4-(啶啉-2-基氨基)苯磺酰胺+TX、8-羟基啶啉硫酸盐+TX、布罗波尔+TX、氢氧化铜+TX、甲酚+TX、双硫氧吡啶+TX、多地辛+TX、地克松+TX、甲醛+TX、萘磺汞+TX、春雷霉素+TX、盐酸春雷霉素水合物+TX、双(二甲基二硫代氨基甲酸)镍+TX、三氯甲基吡啶+TX、辛噻酮+TX、噁啉酸+TX、氧四环素+TX、羟基啶啉硫酸钾+TX、噁菌灵+TX、链霉素+TX、链霉素倍半硫酸盐+TX、叶枯酞+TX、硫柳汞钠+TX、棉褐带卷蛾GV+TX、放射形土壤杆菌(*Agrobacterium radiobacter*)+TX、钝绥螨属物种(*Amblyseius* spp.)+TX、芹菜夜蛾NPV+TX、原缨翅小蜂(*Anagrus atomus*)+TX、短距蚜小蜂(*Aphelinus abdominalis*)+TX、阿布拉小蜂(*Aphidius colemani*)+TX、食蚜瘿蚊(*Aphidoletes aphidimyza*)+TX、苜蓿银纹夜蛾NPV+TX、球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus* Neide)+TX、布氏白僵菌(*Beauveria brongniartii*)+TX、普通草蛉(*Chrysoperla carnea*)+TX、孟氏隐唇瓢虫(*Cryptolaemus montrouzieri*)+TX、苹果小卷蛾GV+TX、西伯利亚离颚茧蜂+TX、潜蝇姬小蜂+TX、丽蚜小蜂+TX、浆角蚜小蜂+TX、嗜菌异小杆线虫和大异小杆线虫(*H.megidis*)+TX、斑长足瓢虫+TX、桔粉介壳虫寄生蜂(*Leptomastix dactylopii*)+TX、白粉虱采用盲蝽+TX、甘蓝夜蛾NPV+TX、黄阔柄跳小蜂(*Metaphycus helvolus*)+TX、金龟子绿僵菌(*Metarhizium anisopliae* var.*acridum*)+TX、金龟子绿僵菌(*Metarhizium anisopliae* var.*acridum*)+TX、松黄叶蜂NPV和红头松树叶蜂NPV+TX、小花蝽属物种(*Orius* spp.)+TX、玫烟色拟青霉+TX、智利小植绥螨+TX、斯氏线虫(*Steinernema bibionis*)+TX、小卷蛾斯氏线虫(*Steinernema carpocapsae*)+TX、夜蛾斯氏线虫(*Steinernema feltiae*)+TX、格氏斯氏线虫(*Steinernema glaseri*)+TX、里约布拉维斯氏线虫(*Steinernema riobrave*)+TX、里约布拉维斯氏线虫(*Steinernema riobrave*)+TX、蝼蛄斯氏线虫(*Steinernema scapterisci*)+TX、斯氏线虫属物种(*Steinernema* spp.)+TX、赤眼蜂属物种(*Trichogramma* spp.)+TX、西方盲走螨(*Typhlodromus occidentalis*)+TX、蜡蚧轮枝菌(*Verticillium lecanii*)+TX、啶磷嗪+TX、双(氮丙啶)甲氨基膦硫化物(bisazir)+TX、白消安+TX、迪麦替夫(dimatif)+TX、六甲噻胺+TX、六甲磷+TX、甲基涕巴+TX、甲硫涕巴+TX、甲基啶磷嗪+TX、不孕啶(morzid)+TX、氟幼脲+TX、涕巴+TX、硫代六甲磷(thiohempa)+TX、噻替哌+TX、曲他胺+TX、乌瑞替派+TX、(E)-癸-5-烯-1-基乙酸酯与(E)-癸-5-烯-1-醇+TX、(E)-乙酸十三碳-4-烯-1-基乙酸酯+TX、(E)-6-甲基庚-2-烯-4-醇+TX、(E,Z)-十四碳-4,10-二烯-1-基乙酸酯+TX、(Z)-十二碳-7-烯-1-基乙酸酯+TX、(Z)-十六碳-11-烯醛+TX、(Z)-十六碳-11-烯-1-基乙酸酯+TX、(Z)-十六碳-13-烯-11-炔-1-基乙酸酯+TX、(Z)-二十碳-13-烯-10-酮+TX、(Z)-十四碳-7-烯-1-醛+TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-醇+TX、(Z)-十四碳-

9-烯-1-基乙酸酯+TX、(7E,9Z)-十二碳-7,9-二烯-1-基乙酸酯+TX、(9Z,11E)-十四碳-9,11-二烯-1-基乙酸酯+TX、(9Z,12E)-十四碳-9,12-二烯-1-基乙酸酯+TX、14-甲基十八碳-1-烯+TX、4-甲基壬-5-醇与4-甲基壬-5-酮+TX、 α -多纹素(alpha-multistriatin)+TX、小蠹性信息素+TX、十二碳二烯醇(codlure)+TX、十二碳二烯醇(codlemone)+TX、诱蝇酮(cuelure)+TX、环氧十九烷+TX、十二碳-8-烯-1-基乙酸酯+TX、十二碳-9-烯-1-基乙酸酯+TX、十二碳-8+TX、10-二烯-1-基乙酸酯+TX、dominalure+TX、4-甲基辛酸乙酯+TX、丁子香酚+TX、弗兰特林(frontalin)+TX、诱杀烯混剂(grandlure)+TX、诱杀烯混剂I+TX、诱杀烯混剂II+TX、诱杀烯混剂III+TX、诱杀烯混剂IV+TX、红蛉诱烯+TX、齿小蠹二烯醇+TX、齿小蠹烯醇+TX、金龟子性诱剂(japonilure)+TX、三甲基二氧三环壬烷(lineatin)+TX、litlure+TX、粉纹夜蛾性诱剂+TX、诱杀酯+TX、美加特酸(megatomoic acid)+TX、甲基丁子香酚+TX、诱虫烯+TX、十八碳-2,13-二烯-1-基乙酸酯+TX、十八碳-3,13-二烯-1-基乙酸酯+TX、贺康彼(orfralure)+TX、椰蛀犀金龟聚集信息素(oryctalure)+TX、非乐康(ostramone)+TX、诱虫环+TX、sordidin+TX、食菌甲诱醇+TX、十四碳-11-烯-1-基乙酸酯+TX、地中海实蝇引诱剂+TX、地中海实蝇引诱剂A+TX、地中海实蝇引诱剂B1+TX、地中海实蝇引诱剂B2+TX、地中海实蝇引诱剂C+TX、trunc-call+TX、2-(辛基硫基)乙醇+TX、避蚊酮+TX、丁氧基(聚丙二醇)+TX、己二酸二丁酯+TX、邻苯二甲酸二丁酯+TX、琥珀酸二丁酯+TX、避蚊胺+TX、碳酸二甲酯+TX、邻苯二甲酸二甲酯+TX、乙基己二醇+TX、己酰胺+TX、甲基喹-丁基+TX、甲基新癸酰胺+TX、草氨酸酯+TX、派卡瑞丁+TX、1-二氯-1-硝基乙烷+TX、1,1-二氯-2,2-双(4-乙基苯基)乙烷+TX、1,2-二氯丙烷与1,3-二氯丙烯+TX、1-溴-2-氯乙烷+TX、2,2,2-三氯-1-(3,4-二氯苯基)乙酸乙酯+TX、2,2-二氯乙基-2-乙基亚磺酰基乙基甲基磷酸酯+TX、2-(1,3-二硫戊环-2-基)苯基二甲基氨基甲酸酯+TX、2-(2-丁氧基乙氧基)硫氰酸乙酯+TX、2-(4,5-二甲基-1,3-二氧戊环-2-基)甲基氨基甲酸苯基酯+TX、2-(4-氯-3,5-二甲苯基氧基)乙醇+TX、2-氯乙烯基二乙基磷酸酯+TX、2-咪唑烷酮+TX、2-异茂酰基茛满-1,3-二酮+TX、2-甲基(丙-2-炔基)氨基苯基甲基氨基甲酸酯+TX、2-硫氰酸基乙基月桂酸酯+TX、3-溴-1-氯丙-1-烯+TX、3-甲基-1-苯基吡唑-5-基二甲基氨基甲酸酯+TX、4-甲基(丙-2-炔基)氨基-3,5-二甲苯基甲基氨基甲酸酯+TX、5,5-二甲基-3-氧代环己-1-烯基二甲基氨基甲酸酯+TX、家蝇磷+TX、丙烯腈+TX、阿耳德林+TX、阿洛氨基菌素+TX、除害威+TX、 α -蜕皮激素+TX、磷化铝+TX、灭害威+TX、新烟碱+TX、乙基杀扑磷(athidathion)+TX、甲基吡啶磷+TX、苏云金芽孢杆菌 δ 内毒素(Bacillus thuringiensis delta endotoxins)+TX、六氟硅酸钡+TX、多硫化钡+TX、熏虫菊+TX、拜耳22/190+TX、拜耳22408+TX、 β -氟氯氰菊酯+TX、 β -氯氰菊酯+TX、戊环苄呋菊酯(bioethanomethrin)+TX、生物氯菊酯+TX、双(2-氯乙基)醚+TX、硼砂+TX、溴苯烯磷+TX、溴-DDT+TX、合杀威+TX、畜虫威+TX、特噻硫磷(butathiofos)+TX、丁酯磷+TX、磷酸钙+TX、氰化钙+TX、二硫化碳+TX、四氯化碳+TX、杀螟丹盐酸盐+TX、瑟瓦定+TX、冰片丹+TX、氯丹+TX、十氯酮+TX、氯仿+TX、氯化苦+TX、氯辛硫磷+TX、氯吡唑磷(chlorprazophos)+TX、顺式-灭虫菊+TX、顺式苄呋菊酯+TX、氰菊酯(clocythrins)+TX、乙酰亚砷酸铜+TX、砷酸铜+TX、油酸铜+TX、畜虫磷+TX、冰晶石+TX、CS 708+TX、苯腈磷+TX、杀螟腈+TX、环菊酯+TX、畜蟀磷+TX、右旋胺菊酯+TX、DAEP+TX、棉隆+TX、脱甲基克百威(decarbofuran)+TX、除线特(diamidafos)+TX、异氯硫磷+TX、除线磷+TX、dicresyl+TX、环虫腈+TX、狄氏剂+TX、5-甲基吡唑-3-基磷酸二乙酯+TX、喘定(dilor)+TX、四氟甲醚菊酯+TX、地麦威+TX、苜蓿酯+TX、甲基毒虫畏+TX、敌

蝇威+TX、丙硝酚+TX、戊硝酚+TX、地乐酚+TX、苯虫醚+TX、蔬果磷+TX、噻喃磷+TX、DSP+TX、脱皮甾酮+TX、EI 1642+TX、EMPC+TX、EPBP+TX、etaphos+TX、杀虫丹+TX、甲酸乙酯+TX、二溴乙烷+TX、二氯乙烷+TX、环氧乙烷+TX、EXD+TX、皮蝇磷+TX、双乙威(fenethacarb)+TX、杀螟松+TX、氧嘧酰胺(fenoxacrim)+TX、吡氯氰菊酯+TX、线虫磷+TX、乙基倍硫磷+TX、氟氯双苯隆(flucofuron)+TX、丁苯硫磷+TX、福司吡酯+TX、丁硫环磷+TX、呋线威+TX、抗虫菊+TX、双胍盐+TX、双胍盐乙酸盐+TX、硫代碳酸钠+TX、苜蓿醚+TX、HCH+TX、HEOD+TX、七氯(heptachlor)+TX、速杀硫磷+TX、HHDN+TX、氰化氢+TX、啉威+TX、IPSP+TX、氯唑磷+TX、碳氯灵+TX、异艾氏剂+TX、异柳磷+TX、isolane+TX、稻瘟灵+TX、异噁唑磷+TX、保幼激素I+TX、保幼激素II+TX、保幼激素III+TX、氯戊环+TX、烯虫炔酯+TX、砷酸铅+TX、溴苯磷+TX、lirimfos+TX、噻唑磷+TX、m-甲基氨基甲酸枯烯酯+TX、磷化镁+TX、叠氮磷+TX、四甲磷+TX、灭蚜硫磷+TX、氯化亚汞+TX、mesulfenfos+TX、威百亩+TX、威百亩-钾+TX、威百亩-钠+TX、甲磺酰氟+TX、丁烯胺磷+TX、甲氧普林+TX、甲醚菊酯+TX、甲氧滴滴涕+TX、异硫氰酸甲酯+TX、三氯乙烷+TX、二氯甲烷+TX、噁虫酮+TX、灭蚁灵+TX、萘肽磷+TX、萘+TX、NC-170+TX、尼古丁+TX、硫酸尼古丁+TX、噁虫醛+TX、降烟碱+TX、0-5-二氯-4-碘苯基0-乙基硫代膦酸酯+TX、0,0-二乙基0-4-甲基-2-氧代-2H-色满-7-基硫代膦酸酯+TX、0,0-二乙基0-6-甲基-2-丙基嘧啶-4-基硫代膦酸酯+TX、0,0,0',0'-四丙基二硫代焦磷酸+TX、油酸+TX、对二氯苯+TX、甲基对硫磷+TX、五氯苯酚+TX、月桂酸五氯苯酯+TX、PH 60-38+TX、芬硫磷+TX、对氯硫磷+TX、膦+TX、甲基辛硫磷+TX、甲胺嘧磷+TX、聚氯二环戊二烯异构体+TX、亚砷酸钾+TX、硫氰酸钾+TX、早熟素I+TX、早熟素II+TX、早熟素III+TX、酰胺嘧啶磷+TX、丙氟菊酯+TX、猛杀威+TX、丙硫磷+TX、定菌磷+TX、反灭虫菊+TX、苦木+TX、甲基噻硫磷+TX、畜宁磷+TX、雷复尼特+TX、灭虫菊+TX、鱼藤酮+TX、噁噁菊酯+TX、鱼尼汀+TX、利阿诺定+TX、沙巴藜芦(sabadilla)+TX、八甲磷+TX、克线丹+TX、SI-0009+TX、蛾蝇腈+TX、亚砷酸钠+TX、氰化钠+TX、氟化钠+TX、六氟硅酸钠+TX、五氯酚钠+TX、硒酸钠+TX、硫氰酸钠+TX、磺苯醚隆(sulcofuron)+TX、磺苯醚隆钠盐(sulcofuron-sodium)+TX、磺酰氟+TX、硫丙磷+TX、焦油+TX、噁螨威+TX、TDE+TX、丁基嘧啶磷+TX、硫甲双磷+TX、环戊烯丙菊酯+TX、四氯乙烷+TX、噁氯磷+TX、杀虫环+TX、杀虫环草酸氢盐+TX、虫线磷+TX、杀虫单+TX、杀虫单钠+TX、四溴菊酯+TX、反氯菊酯+TX、啞蚜威+TX、异皮蝇磷-3+TX、毒壤膦+TX、混杀威+TX、三氟甲氧威(tolprocarb)+TX、氯啞菌酯+TX、烯虫硫酯+TX、藜芦定+TX、藜芦碱+TX、XMC+TX、zetamethrin+TX、磷化锌+TX、啞虫磷+TX、以及氯氟醚菊酯+TX、四氟醚菊酯+TX、双(三丁基锡)氧化物+TX、溴乙酰胺+TX、磷酸铁+TX、氯硝柳胺+TX、三丁基锡氧化物+TX、吡吗啉+TX、杀螺吗啉+TX、1,2-二溴-3-氯丙烷+TX、1,3-二氯丙烯+TX、3,4-二氯四氢噻吩1,1-二氧化物+TX、3-(4-氯苯基)-5-甲基罗丹宁+TX、5-甲基-6-硫代-1,3,5-噻二嗪烷-3-基乙酸+TX、6-异戊烯基氨基嘌呤+TX、anisiflupurin+TX、苜蓿噁+TX、细胞分裂素(cytokinins)+TX、DCIP+TX、糠醛+TX、异酰胺磷(isamidofos)+TX、凯因庭+TX、疣孢漆斑菌组合物(Myrothecium verrucaria composition)+TX、四氯噻吩+TX、二甲苯酚+TX、玉米素+TX、乙基黄原酸钾+TX、活化酯(acibenzolar)+TX、活化酯-S-甲基+TX、大虎杖(Reynoutria sachalinensis)提取物+TX、 α -氯代醇+TX、安妥+TX、碳酸钡+TX、双鼠脲+TX、溴鼠灵+TX、溴敌隆+TX、溴鼠胺+TX、氯鼠酮+TX、胆钙化醇(cholecalciferol)+TX、氯杀鼠灵+TX、克灭鼠+TX、杀鼠醚+TX、杀鼠嘧啶+TX、鼠得克(difenacoum)+TX、噁鼠灵+TX、敌鼠+TX、钙化醇(ergocalciferol)+TX、氟鼠灵+TX、氟乙酰胺+TX、氟鼠啞+TX、盐酸氟鼠啞+TX、鼠特灵+TX、

毒鼠磷+TX、磷+TX、杀鼠酮+TX、pyrinuron+TX、海葱葡苷(scilliroside)+TX、氟乙酸钠+TX、硫酸铈+TX、华法林+TX、胡椒酸2-(2-丁氧基乙氧基)乙酯+TX、5-(1,3-苯并间二氧杂环戊烯-5-基)-3-己基环己-2-烯酮+TX、法尼醇与橙花叔醇+TX、增效炔醚(verbutin)+TX、MGK 264+TX、增效醚(piperonyl butoxide)+TX、增效醛+TX、增效酯(propyl isomer)+TX、S421+TX、增效菊+TX、芝麻酚林(sesasmolin)+TX、亚砷+TX、葱醌+TX、环烷酸铜+TX、氯化铜+TX、双环戊二烯+TX、福美双+TX、环烷酸锌+TX、福美锌+TX、衣马宁(imanin)+TX、利巴韦林+TX、氯吡啶酰胺+TX、氧化汞+TX、甲基硫菌灵+TX、阿扎康唑+TX、联苯三唑醇+TX、糠菌唑+TX、环丙唑醇+TX、苯醚甲环唑+TX、烯唑醇+TX、氟环唑+TX、腈苯唑+TX、氟唑唑+TX、氟硅唑+TX、粉唑醇+TX、呋吡菌胺+TX、己唑醇+TX、抑霉唑+TX、亚胺唑+TX、种菌唑+TX、叶菌唑+TX、腈菌唑+TX、多效唑(paclobutrazole)+TX、戊菌唑+TX、戊菌唑+TX、丙硫菌唑+TX、啉斑肟+TX、咪鲜胺(prochloraz)+TX、丙环唑+TX、啉菌噁唑+TX、硅氟唑+TX、戊唑醇+TX、氟醚唑+TX、三唑酮+TX、三唑醇+TX、氟菌唑+TX、灭菌唑+TX、嘧啶醇+TX、氯苯嘧啶醇+TX、氟苯嘧啶醇+TX、磺酸丁嘧啶+TX、二甲嘧啶+TX、乙嘧啶+TX、吗菌灵+TX、苯锈啶+TX、丁苯吗啉+TX、螺环菌胺+TX、克林菌+TX、嘧菌环胺+TX、嘧菌胺+TX、嘧霉胺+TX、拌种咯(fenpiclonil)+TX、咯菌腈+TX、苯霜灵(benalaxyl)+TX、呋霜灵(furalaxyl)+TX、甲霜灵+TX、R-甲霜灵+TX、呋酰胺+TX、噁霜灵+TX、多菌灵+TX、咪菌威(debacarb)+TX、麦穗宁+TX、噁菌灵+TX、乙菌利+TX、菌核利+TX、甲菌利(myclozoline)+TX、腐霉利+TX、乙炔菌核利+TX、啉酰菌胺+TX、萎锈灵+TX、甲呋酰胺+TX、氟酰胺+TX、灭锈胺+TX、氧化萎锈灵+TX、吡噻菌胺+TX、噁呋酰胺+TX、多果定+TX、双胍辛胺+TX、嘧菌酯+TX、醚菌胺+TX、烯肟菌酯+TX、烯肟菌胺+TX、氟菌麟酯+TX、氟嘧菌酯+TX、甲氧胺菌灵+TX、苯氧菌胺+TX、肟菌酯+TX、肟醚菌胺+TX、啉氧菌酯+TX、唑菌胺酯+TX、唑胺菌酯+TX、唑菌酯+TX、福美铁+TX、代森锰锌(mancozeb)+TX、代森锰(maneb)+TX、代森联+TX、甲基代森锌+TX、代森锌+TX、敌菌丹+TX、克菌丹+TX、唑呋草+TX、灭菌丹+TX、对甲抑菌灵+TX、波尔多混合剂+TX、氧化铜+TX、代森猛铜(mancopper)+TX、啉啉铜+TX、酞菌酯(nitrothal-isopropyl)+TX、克瘟散+TX、异稻瘟净+TX、氯瘟磷+TX、甲基立枯磷+TX、防霉灵+TX、苯噻菌胺(benthiavalicarb)+TX、灰瘟素-S+TX、地茂散+TX、百菌清+TX、环氟菌胺+TX、霜脲氰+TX、cyclobutrifluram+TX、双氯氰菌胺+TX、啉菌酮+TX、氯硝胺+TX、乙霉威+TX、达灭芬+TX、氟吗啉+TX、二噻农+TX、噁唑菌胺+TX、土菌灵+TX、噁唑菌酮+TX、咪唑菌酮+TX、氰菌胺+TX、嘧菌胺+TX、氟啉胺+TX、氟米特索弗密(flumetylsulfonil)+TX、氟吡菌胺(fluopicolide)+TX、氟缇奥康纳唑(fluxotyconazole)+TX、磺菌胺(flusulfamide)+TX、氟唑菌酰胺(fluxapyroxad)+TX、环酰菌胺+TX、三乙膦酸铝+TX、恶霉灵(hymexazol)+TX、丙森锌+TX、赛座灭(cyazofamid)+TX、磺菌威(methasulfocarb)+TX、苯菌酮+TX、戊菌隆(pencycuron)+TX、苯酞+TX、多氧霉素(polyoxins)+TX、霜霉威+TX、吡菌苯威(pyribencarb)+TX、碘唑啉酮(proquinazid)+TX、咯唑啉酮(pyroquilon)+TX、苯啉菌酮(pyriofenone)+TX、啉氧灵+TX、五氯硝基苯+TX、噁酰菌胺+TX、咪唑啉酮(triazoxide)+TX、三环唑+TX、啉氧灵+TX、有效霉素(validamycin)+TX、缬菌胺(valifenalate)+TX、苯酰菌胺(zoxamide)+TX、双炔酰菌胺(mandipropamid)+TX、氟苯醚酰胺(flubeneteram)+TX、吡啶萘菌胺(isopyrazam)+TX、氟唑环菌胺(sedaxane)+TX、苯并烯氟菌唑(benzovindiflupyr)+TX、氟唑菌酰胺(pydiflumetofen)+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酸(3',4',5'-三氟-联苯-2-基)-酰胺+TX、异氟普兰(isoflucypram)+TX、异噁菌胺(isotianil)+TX、地芬灭替松

(dipymetitrone)+TX、6-乙基-5,7-二氧化代-吡咯并[4,5][1,4]二噻英并[1,2-c]异噻唑-3-甲腈+TX、2-(二氟甲基)-N-[3-乙基-1,1-二甲基-茛满-4-基]吡啶-3-甲酰胺+TX、4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基-5-苯基-哒嗪-3-甲腈+TX、(R)-3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[1,1,3-三甲基茛满-4-基]吡啶-4-甲酰胺+TX、4-(2-溴-4-氟-苯基)-N-(2-氯-6-氟-苯基)-2,5-二甲基-吡啶-3-胺+TX、4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡啶-5-胺+TX、氟茛唑菌胺(fluindapyr)+TX、甲香菌酯(coumoxystrobin)(jiaxianggunzhi)+TX、鲁本米西安(lvbenmixianan)+TX、二氯苯偶氮(dichlobentiazox)+TX、曼德斯宾(mandestrobin)+TX、3-(4,4-二氟-3,4-二氢-3,3-二甲基异喹啉-1-基)喹诺酮+TX、2-[2-氟-6-[(8-氟-2-甲基-3-喹啉基)氧基]苯基]丙-2-醇+TX、氟噻唑吡乙酮+TX、N-[6-[[[(1-甲基四唑-5-基)苯基-亚甲基]氨基]氧基甲基]-2-吡啶基]氨基甲酸叔丁酯+TX、联苯吡嗪菌胺(pyraziflumid)+TX、英派尔福沙姆(inpyrfluxam)+TX、曲普卡(trolprocarb)+TX、氯氟醚菌唑+TX、异芬特氟克那唑(ipfentrifluconazole)+TX、2-(二氟甲基)-N-[(3R)-3-乙基-1,1-二甲基-茛满-4-基]吡啶-3-甲酰胺+TX、N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-[4-(4,5-二氯噻唑-2-基)氧基-2,5-二甲基-苯基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、[2-[3-[2-[1-[2-[3,5-双(二氟甲基)吡啶-1-基]乙酰基]-4-哌啶基]噻唑-4-基]-4,5-二氢异噻唑-5-基]-3-氯-苯基]甲磺酸盐+TX、N-[6-[[Z)-[(1-甲基四唑-5-基)-苯基-亚甲基]氨基]氧基甲基]-2-吡啶基]氨基甲酸丁-3-炔酯+TX、N-[5-[4-(2,4-二甲基苯基)三唑-2-基]-2-甲基-苯基]甲基]氨基甲酸甲酯+TX、3-氯-6-甲基-5-苯基-4-(2,4,6-三氟苯基)哒嗪+TX、吡啶达氯甲基(pyridachlometyl)+TX、3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[1,1,3-三甲基茛满-4-基]吡啶-4-甲酰胺+TX、1-[2-[[1-(4-氯苯基)吡啶-3-基]氧基甲基]-3-甲基-苯基]-4-甲基-四唑-5-酮+TX、1-甲基-4-[3-甲基-2-[[2-甲基-4-(3,4,5-三甲基吡啶-1-基)苯氧基]甲基]苯基]四唑-5-酮+TX、爱米诺庇力芬(aminopyrifen)+TX、唑啉菌胺(ametoctradin)+TX、吡啶磺菌胺(amisulbrom)+TX、氟唑菌苯胺(penflufen)+TX、(Z,2E)-5-[1-(4-氯苯基)吡啶-3-基]氧基-2-甲氧基亚氨基-N,3-二甲基-戊-3-烯酰胺+TX、吡啶菌酰胺(florylpicoxamid)+TX、苯吡克咪德(fenpicoxamid)+TX、米哌沙米(metarylpicoxamid)+TX、异丁乙氧喹啉(tebufloquin)+TX、氟苯喹(ipflufenquin)+TX、奎诺福林(quinofumelin)+TX、异丙噻菌胺(isofetamid)+TX、乙基1-[4-[2-(三氟甲基)-1,3-二氧戊环-2-基]甲氧基]苯基]甲基]吡啶-3-甲酸酯(可以由W0 2020/056090中描述的方法制备)+TX、乙基1-[4-[Z)-2-乙氧基-3,3,3-三氟-丙-1-烯氧基]苯基]甲基]吡啶-3-甲酸酯(可以由W0 2020/056090中描述的方法制备)+TX、甲基N-[4-[1-(4-环丙基-2,6-二氟-苯基)吡啶-4-基]-2-甲基-苯基]甲基]氨基甲酸酯(可以由W0 2020/097012中描述的方法制备)+TX、甲基N-[4-[1-(2,6-二氟-4-异丙基-苯基)吡啶-4-基]-2-甲基-苯基]甲基]氨基甲酸酯(可以由W0 2020/097012中描述的方法制备)+TX、N-[2-[2,4-二氯-苯氧基]苯基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-吡啶-4-甲酰胺+TX、N-[2-[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]苯基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-吡啶-4-甲酰胺+TX、苯噻菌酯(benzothioestrobin)+TX、氰烯菌酯(phenamacril)+TX、5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇锌盐(2:1)+TX、氟吡菌酰胺(fluopyram)+TX、氟芬诺萨迪塞姆(flufenoxadiazam)+TX、氟噻唑菌腈(flutianil)+TX、氟醚菌酰胺(fluopimomide)+TX、吡丙炔(pyrapropoyne)+TX、哌碳唑(picarbutrazox)+TX、2-(二氟甲基)-N-(3-乙基-1,1-二甲基-茛满-4-基)吡啶-3-甲酰胺+TX、2-(二氟甲基)-N-((3R)-1,1,

3-三甲基茛满-4-基)吡啶-3-甲酰胺+TX、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羟基-3-(1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲脒+TX、美特尔特特拉普罗(metyltetraprole)+TX、2-(二氟甲基)-N-((3R)-1,1,3-三甲基茛满-4-基)吡啶-3-甲酰胺+TX、 α -(1,1-二甲基乙基)- α -[4'-(三氟甲氧基)[1,1'-二苯基]-4-基]-5-噻啉甲醇+TX、氟哌啶(fluoxapiprolin)+TX、烯肟菌酯(enoxastrobin)+TX、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羟基-3-(1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲脒+TX、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羟基-3-(5-硫烷基-1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲脒+TX、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羟基-3-(5-硫代-4H-1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲脒+TX、抗倒酸(trinexapac)+TX、丁香菌酯(coumoxystrobin)+TX、中生菌素(zhongshengmycin)+TX、噻菌铜(thiodiazole copper)+TX、噻啉锌+TX、苯啉啉菌胺(amectotractin)+TX、异菌脲(iprodione)+TX、辛菌胺+TX;N'-[5-溴-2-甲基-6-[(1S)-1-甲基-2-丙氧基-乙氧基]-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-[5-溴-2-甲基-6-[(1R)-1-甲基-2-丙氧基-乙氧基]-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-[5-溴-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-[5-氯-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-[5-溴-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-异丙基-N-甲基-甲脒+TX(这些化合物可以由W02015/155075中描述的方法制备);N'-[5-溴-2-甲基-6-(2-丙氧基丙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX(此化合物可以由IPCOM000249876D中描述的方法制备);N-异丙基-N'-[5-甲氧基-2-甲基-4-(2,2,2-三氟-1-羟基-1-苯基-乙基)苯基]-N-甲基-甲脒+TX、N'-[4-(1-环丙基-2,2,2-三氟-1-羟基-乙基)-5-甲氧基-2-甲基-苯基]-N-异丙基-N-甲基-甲脒+TX(这些化合物可以由W02018/228896中描述的方法制备);N-乙基-N'-[5-甲氧基-2-甲基-4-[(2-三氟甲基)氧杂环丁-2-基]苯基]-N-甲基-甲脒+TX、N-乙基-N'-[5-甲氧基-2-甲基-4-[(2-三氟甲基)四氢呋喃-2-基]苯基]-N-甲基-甲脒+TX(这些化合物可以由W02019/110427中描述的方法制备);N-[(1R)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1S)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1R)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1S)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1R)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1S)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、8-氟-N-[(1R)-1-[(3-氟苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]喹啉-3-甲酰胺+TX、8-氟-N-[(1S)-1-[(3-氟苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1R)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1S)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-((1R)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基)-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-((1S)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基)-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX(这些化合物可以由W02017/153380中描述的方法制备);1-(6,7-二甲基吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4,5-三氟-3,3-二甲基-异喹啉+TX、1-(6,7-二甲基吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4,6-三氟-3,3-二甲基-异喹啉+TX、4,4-二氟-3,3-二甲基-1-(6-甲基吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)异喹啉+TX、4,4-二氟-3,3-二甲基-1-(7-甲基吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)异喹啉+TX、1-(6-氯-7-甲基-吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-异喹啉+TX(这些化合物可以由W02017/025510中描述的方法制备);1-(4,5-二甲基苯并咪唑-1-基)-4,4,5-三氟-3,3-二甲

基-异喹啉+TX、1-(4,5-二甲基苯并咪唑-1-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-异喹啉+TX、6-氯-4,4-二氟-3,3-二甲基-1-(4-甲基苯并咪唑-1-基)异喹啉+TX、4,4-二氟-1-(5-氟-4-甲基-苯并咪唑-1-基)-3,3-二甲基-异喹啉+TX、3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-1-异喹啉基)-7,8-二氢-6H-环戊二烯并[e]苯并咪唑+TX(这些化合物可以由W0 2016/156085中描述的方法制备);N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]环丙烷甲酰胺+TX、N,2-二甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙酰胺+TX、N-乙基-2-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙酰胺+TX、1-甲氧基-3-甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脲+TX、1,3-二甲氧基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脲+TX、3-乙基-1-甲氧基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脲+TX、N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙酰胺+TX、4,4-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]异噁唑烷-3-酮+TX、5,5-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]异噁唑烷-3-酮+TX、1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡唑-4-甲酸乙酯+TX、N,N-二甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]-1,2,4-三唑-3-胺+TX。此段落中的化合物可以由W0 2017/055473、W0 2017/055469、W0 2017/093348和W0 2017/118689中描述的方法制备;2-[6-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇+TX(此化合物可以由W0 2017/029179中描述的方法制备);2-[6-(4-溴苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇+TX(此化合物可以由W0 2017/029179中描述的方法制备);3-[2-(1-氯环丙基)-3-(2-氟苯基)-2-羟基-丙基]咪唑-4-甲腈+TX(此化合物可以由W0 2016/156290中描述的方法制备);3-[2-(1-氯环丙基)-3-(3-氯-2-氟-苯基)-2-羟基-丙基]咪唑-4-甲腈+TX(此化合物可以由W0 2016/156290中描述的方法制备);2-氨基-6-甲基-吡啶-3-甲酸(4-苯氧基苯基)甲酯+TX(此化合物可以由W0 2014/006945中描述的方法制备);2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二噻英并[2,3-c:5,6-c']联吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮+TX(此化合物可以由W0 2011/138281中描述的方法制备);N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]硫代苯甲酰胺+TX;N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺+TX;(Z,2E)-5-[1-(2,4-二氯苯基)吡唑-3-基]氧基-2-甲氧基亚氨基-N,3-二甲基-戊-3-烯胺+TX(此化合物可以由W0 2018/153707中描述的方法制备);N'-[2-氯-5-甲基-4-苯氧基-苯基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX;N'-[2-氯-4-(2-氟苯氧基)-5-甲基-苯基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX(此化合物可以由W0 2016/202742中描述的方法制备);2-(二氟甲基)-N-[(3S)-3-乙基-1,1-二甲基-茛满-4-基]吡啶-3-甲酰胺+TX(此化合物可以由W0 2014/095675中描述的方法制备);(5-甲基-2-吡啶基)-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲酮+TX、(3-甲基异噁唑-5-基)-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲酮+TX(这些化合物可以由W0 2017/220485中描述的方法制备);2-氧代-N-丙基-2-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙酰胺+TX(此化合物可以由W0 2018/065414中描述的方法制备);1-[[5-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]-2-噻吩基]甲基]吡唑-4-甲酸乙酯+TX(此化合物可以由W0 2018/158365中描述的方法制备);2,2-二氟-N-甲基-2-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙酰胺+TX、N-[(E)-甲氧基亚氨基甲基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺+TX、N-[(Z)-甲氧基亚氨基甲基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯

甲酰胺+TX、N-[N-甲氧基-C-甲基-碳酰亚胺基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺+TX(这些化合物可以由WO 2018/202428中描述的方法制备)；

[1031] 微生物,其包括:微生物剂,包括:鲁氏不动杆菌+TX、枝顶孢属真菌+TX+TX、顶头孢霉菌+TX+TX、柿树支顶孢菌(*Acremonium diospyri*)+TX、双倒卵形支顶孢菌(*Acremonium obclavatum*)+TX、棉褐带卷蛾颗粒体病毒(*AdoxGV*) (**Capex®**)+TX、放射形土壤杆菌菌株K84 (*Galltrol-A®*)+TX、链格孢菌+TX、决明链格孢+TX、损毁链格孢(*Alternaria destruens*) (**Smolder®**)+TX、白粉寄生孢(**AQ10®**)+TX、黄曲霉AF36(**AF36®**)+TX、黄曲霉NRRL 21882(**Aflaguard®**)+TX、曲霉属物种+TX、出芽短梗霉菌+TX、固氮螺菌+TX (**MicroAZ®**+TX、**TAZO B®**)+TX、固氮菌+TX、褐球固氮菌(*Azotobacter chroococcum*) (**Azotomeal®**)+TX、固氮菌囊孢(*Bionatural Blooming Blossoms®*)+TX、解淀粉芽孢杆菌+TX、蜡样芽孢杆菌+TX、蚀几丁质芽孢杆菌菌株(*Bacillus chitinosporus* strain) CM-1+TX、蚀几丁质芽孢杆菌菌株(*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 Releaf®**)+TX、环状芽孢杆菌+TX、坚强芽孢杆菌 (**BioSafe®**+TX、**BioNem-WP®**+TX、**VOTIVO®**)+TX、坚强芽孢杆菌菌株I-1582+TX、浸麻芽孢杆菌+TX、死海芽孢杆菌(*Bacillus marismortui*)+TX、巨大芽孢杆菌+TX、蕈状芽孢杆菌菌株AQ726+TX、乳突芽孢杆菌 (*Milky Spore Powder®*)+TX、短小芽孢杆菌属物种+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、芽孢杆菌属物种+TX、芽孢杆菌属菌株AQ175+TX、芽孢杆菌属菌株AQ177+TX、芽孢杆菌属菌株AQ178+TX、枯草芽孢杆菌菌株QST 713 (**CEASE®**+TX、**Serenade®**+TX、**Rhapsody®**)+TX、枯草芽孢杆菌菌株QST 714 (**JAZZ®**)+TX、枯草芽孢杆菌菌株AQ153+TX、枯草芽孢杆菌菌株AQ743+TX、枯草芽孢杆菌菌株QST3002+TX、枯草芽孢杆菌菌株QST3004+TX、解淀粉枯草芽孢杆菌变种菌株FZB24 (**Taegro®**+TX、**Rhizopro®**)+TX、苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*) Cry 2Ae+TX、苏云金芽孢杆菌Cry1Ab+TX、苏云金芽孢杆菌鲇泽亚种(*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(*Bacillus thuringiensis kurstaki*) 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(*Bacillus thuringiensis* strain) BD#32+TX、苏云金芽孢杆菌菌株AQ52+TX、苏云金芽孢杆菌鲇泽变种(*Bacillus thuringiensis* var. *aizawai*) (

XenTari®+TX、**DiPel®**+TX、细菌属物种 (**GROWMEND®**+TX、**GROWSWEET®**+TX、**Shootup®**) +TX、密执安棍状杆菌的噬菌体 (bacteriophage of *Clavipacter michiganensis*) (**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*) (**Engerlingspitz®**+TX、**Schweizer Beauveria®**+TX、**Melocont®**) +TX、白僵菌属物种 (*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 (**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+TX、伯克霍尔德菌属物种+TX、加拿大蓟真菌 (*Canadian thistle fungus*) (CBH Canadian **Bioherbicide®**) +TX、乳酪假丝酵母 (*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0+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、瑞氏假丝酵母 (*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、假丝酵母属物种 (*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、绿头枝孢 (*Cladosporium chlorocephalum*) +TX、枝孢属物种 (*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、盾壳霉属物种 (*Coniothyrium* spp.) +TX、浅白隐球酵母 (*Cryptococcus albidus*) (**YIELDPLUS®**) +TX、土生隐球菌 (*Cryptococcus humicola*) +TX、隐球酵母属 *infirmitus*-*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、*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/Carpovirusine®**) +TX、*Cylindrobasidium laeve* (**Stumpout®**) +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、附球菌(Epicoccum nigrum)+TX、黑附球菌(Epicoccum purpurascens)+TX、附球孢属物种+TX、Filobasidium floriforme+TX、锐顶镰孢菌(Fusarium acuminatum)+TX、厚孢镰刀菌(Fusariumchlamydosporum)+TX、尖孢镰刀菌(Fusarium oxysporum) (**Fusaclean®/ Biofox C®**) +TX、层出镰刀菌(Fusarium proliferatum)+TX、镰刀菌属物种(Fusarium spp.)+TX、白地霉(Galactomyces geotrichum)+TX、链孢粘帚霉(Gliocladium catenulatum) (**Primastop®+TX, Prestop®**) +TX、粉红粘帚霉(Gliocladium roseum) +TX、粘帚霉属物种(Gliocladium spp.) (**SoilGard®**) +TX、绿粘帚霉(Gliocladium virens) (**Soilgard®**) +TX、颗粒体病毒(Granulovirus) (**Granupom®**) +TX、嗜盐盐芽孢杆菌(Halobacillus halophilus)+TX、岸喜盐芽孢杆菌(Halobacillus litoralis)+TX、特氏盐芽孢杆菌(Halobacillus trueperi)+TX、盐单胞菌属物种(Halomonas spp.)+TX、冰下盐单胞菌(Halomonas subglaciescola)+TX、多变盐弧菌(Halovibrio variabilis)+TX、葡萄汁有孢汉逊酵母(Hanseniaspora uvarum)+TX、棉铃虫核型多角体病毒(Helicoverpa armigera nucleopolyhedrovirus) (**Helicovex®**) +TX、谷实夜蛾核型多角体病毒(Helicoverpa zea nuclear polyhedrosis virus) (**Gemstar®**) +TX、异黄酮- 芒柄花黄素(Isoflavone-formononetin) (**Myconate®**) +TX、柠檬克勒克酵母(Kloeckera apiculata)+TX、克勒克酵母属物种(Kloeckera spp.)+TX、大链壶菌(Lagenidium giganteum) (**Laginex®**) +TX、长孢蜡蚧菌(Lecanicillium longisporum) (**Vertiblast®**) +TX、蝇蚧疥霉(Lecanicillium muscarium) (**Vertikil®**) +TX、舞毒蛾核型多角体病毒(Lymantria Dispar nucleopolyhedrosis virus) (**Disparvirus®**) +TX、嗜盐海球菌(Marinococcus halophilus)+TX、格氏梅拉菌(Meira geulakonigii)+TX、绿僵菌(Metarhizium anisopliae) (**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、天蓝色小单孢菌(Micromonospora coerulea)+TX、Microsphaeropsis ochracea+TX、恶臭白色真菌(Muscodor albus) 620 (**Muscudor®**) +TX、Muscodor roseus菌株A3-5+TX、菌根属物种(Mycorrhizae spp.) (**AMykor®**) +TX、Root **Maximizer®**) +TX、疣孢漆斑菌菌株(Myrothecium verrucaria strain) 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(Paecilomyces fumosoroseus) (**PFR-97®+TX, PreFeRal®**) +TX、淡紫拟青霉(Paecilomyces linacinus) (Biostat **WP®**) +TX、淡紫拟青霉菌株(Paecilomyces lilacinus strain) 251 (MeloCon **WG®**) +TX、多粘类芽孢杆菌(Paenibacillus

polymyxa)+TX、成团泛菌(*Pantoea agglomerans*) (BlightBan C9-1®)+TX、泛菌属物种(*Pantoea* spp.)+TX、巴斯德氏芽菌属物种(*Pasteuria* spp.) (**Econem®**)+TX、拟斯扎瓦氏杆菌(*Pasteuria nishizawae*) +TX、黄灰青霉(*Penicillium aurantiogriseum*) +TX、拜赖青霉(*Penicillium billai*) (**Jumpstart®**+TX、**TagTeam®**) +TX、短密青霉(*Penicillium brevicompactum*) +TX、常现青霉(*Penicillium frequentans*) +TX、灰黄青霉(*Penicillium griseofulvum*) +TX、产紫青霉(*Penicillium purpurogenum*) +TX、青霉菌属物种(*Penicillium* spp.) +TX、纯绿色青霉(*Penicillium viridicatum*) +TX、大伏革菌(*Phlebiopsis gigantea*) (**Rotstop®**) +TX、解磷细菌(phosphate solubilizing bacteria) (**Phosphomeal®**) +TX、隐地疫霉(*Phytophthora cryptogea*) +TX、棕榈疫霉(*Phytophthora palmivora*) (**Devine®**) +TX、异常毕赤酵母(*Pichia anomala*) +TX、季也蒙毕赤氏酵母(*Pichia guillemondii*) +TX、膜醭毕赤氏酵母(*Pichia membranaefaciens*) +TX、指甲毕赤酵母(*Pichia onychis*) +TX、树干毕赤酵母(*Pichia stipites*) +TX、铜绿假单胞菌(*Pseudomonas aeruginosa*) +TX、致金色假单胞菌(*Pseudomonas aureofasciens*) (Spot-Less **Biofungicide®**) +TX、洋葱假单胞菌(*Pseudomonas cepacia*) +TX、绿针假单胞菌(*Pseudomonas chlororaphis*) (**AtEze®**) +TX、皱褶假单胞菌(*Pseudomonas corrugate*) +TX、荧光假单胞菌菌株(*Pseudomonas fluorescens* strain) A506 (BlightBan **A506®**) +TX、恶臭假单胞菌(*Pseudomonas putida*) +TX、*Pseudomonas reactans* +TX、假单胞菌属物种(*Pseudomonas* spp.) +TX、丁香假单胞菌(*Pseudomonas syringae*) (**Bio-Save®**) +TX、绿黄假单胞菌(*Pseudomonas viridiflava*) +TX、荧光假单胞菌(**Zequanox®**) +TX、*Pseudozyma flocculosa* 菌株PF-A22UL (**Sporodex L®**) +TX、纵沟柄锈菌(*Puccinia canaliculata*) +TX、*Puccinia thlaspeos* (Wood **Warrior®**) +TX、*Pythium paroecandrum* +TX、侧雄腐霉菌(*Pythium oligandrum*) (**Polygandron®** +TX、**Polyversum®**) +TX、缠器腐霉(*Pythium periplocum*) +TX、水生拉恩菌(*Rhanelia aquatilis*) +TX、拉恩菌属物种(*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(*Rhodosporeidium diobovatum*) +TX、圆红冬孢酵母菌(*Rhodosporeidium toruloides*) +TX、红酵母属物种(*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(Spod-**X®** +TX、**Spexit®**) +TX、粘质沙雷氏菌(*Serratia marcescens*) +TX、普城沙雷菌(*Serratia plymuthica*) +TX、沙雷氏菌属物种(*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、红拟孢酵母(*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、铁艾酵母属物种(*Tilletiopsis* spp.)+TX、棘孢木霉(*Trichoderma asperellum*) (T34 **Biocontrol®**)+TX、盖姆斯木霉(*Trichoderma gamsii*) (**Tenet®**)+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T-39 (**Trichodex®**)+TX、非钩木霉(*Trichoderma inhamatum*)+TX、康宁木霉(*Trichoderma koningii*)+TX、木霉属物种(*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GL-21) (**SoilGuard®**)+TX、绿色木霉+TX、绿色木霉菌株ICC 080(**Remedier®**)+TX、茁芽丝孢酵母(*Trichosporon pullulans*)+TX、毛孢子菌属物种(*Trichosporon* spp.)+TX、单端孢属物种(*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 chlamydosporium*)+TX、蜡蚧轮枝菌(*Verticillium lecanii*) (**Mycotal®**+TX、**Vertalec®**)+TX、Vip3Aa20 (**VIPTera®**)+TX、死海枝芽孢杆菌(*Virgibacillus marismortui*)+TX、野油菜黄单胞菌早熟禾致病变种(*Xanthomonas campestris* pv. *Poae*) (**Camperico®**)+TX、伯氏致病杆菌+TX、嗜线虫致病杆菌；

[1032] 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-胡椒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、Nepeta catarina+TX、烟碱+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-迷迭香和胡椒薄荷提取物混合物(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®**) ;

[1033] 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)(Snip7Fly **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、番茄蛴虫(Tomato Pinworm)信息素(3M Sprayable **pheromone®**)+TX、衣透斯特粉末(Entostat powder)(来自棕榈树的提取物)(Exosex**CM®**)+TX、(E+TX,Z+TX,Z)-3+TX,8+TX,11十四碳三烯乙酸酯+TX、(Z+TX,Z+TX,E)-7+TX,11+TX,13-十六三烯醛+TX、(E+TX,Z)-7+TX,9-十二碳二烯-1-基乙酸酯+TX、2-甲基-1-丁醇+TX、乙酸钙+TX、**Scenturion®**+TX、**Biolure®**+TX、**Check-Mate®**+TX、薰衣草千里酸酯(Lavandulyl senecioate) ;

[1034] 宏生物剂(Macrobial),包括:短距蚜小蜂(Aphelinus abdominalis)+TX、阿尔蚜茧蜂(Aphidius ervi)(Aphelinus-**System®**)+TX、Acerophagus papaya+TX、二星瓢虫(Adalia bipunctata)(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(Ageniaspis fuscicollis)+TX、安德森钝绥螨(Amblyseius andersoni)(**Anderline®**)+TX、Andersoni-**System®**)+TX、加州钝绥螨(Amblyseius californicus)(**Amblyline®**+TX、**Spical®**)+TX、黄瓜钝绥螨(Amblyseius cucumeris)(**Thripex®**+TX、Bugline **cucumeris®**)+TX、伪钝绥螨(Amblyseius fallacis)(**Fallacis®**)+TX、斯氏钝绥螨(Amblyseius swirskii)(Bugline **swirskii®**+TX、Swirskii-**Mite®**)+TX、奥氏钝绥螨(Amblyseius womersleyi)(**WomerMite®**)+TX、粉虱细蜂(Amitus

hesperidum)+TX、原樱翅缨小蜂 (*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、棉蚜寄生蜂 (*Aphidius colemani*) (**Ahipar®**)+TX、阿尔蚜茧蜂 (*Aphidius ervi*) (**Ervipar®**)+TX、烟蚜茧蜂 (*Aphidius gifuensis*)+TX、桃赤蚜蚜茧蜂 (*Aphidius matricariae*) (*Ahipar-M®*)+TX、食蚜瘿蚊 (*Aphidoletes aphidimyza*) (**Aphidend®**)+TX、食蚜瘿蚊 (**Aphidoline®**)+TX、岭南黄蚜小蜂 (*Aphytis lingnanensis*)+TX、印巴黄蚜小蜂 (*Aphytis melinus*)+TX、哈氏长尾啮小蜂 (*Aprostocetus hagenowii*)+TX、蚁形隐翅甲 (*Atheta coriaria*) (**Staphyline®**)+TX、熊蜂属物种 (*Bombus* spp.)+TX、欧洲熊蜂 (*Bombus terrestris*) (*Natupol Beehive®*)+TX、欧洲熊蜂 (**Beeline®**+TX、**Tripol®**)+TX、*Cephalonomia stephanoderis*+TX、黑背唇瓢虫 (*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、四带瑟姬小蜂 (*Cirrospilus quadristriatus*)+TX、白星橘啮小蜂 (*Citrostichus phyllocnistoides*)+TX、*Closterocerus chamaeleon*+TX、*Closterocerus* spp.+TX、*Coccidoxenoides perminutus* (**Planopar®**)+TX、泊蚜小蜂 (*Coccophagus cowperi*)+TX、赖食蚧蚜小蜂 (*Coccophagus lycimnia*)+TX、螟黄足盘绒茧蜂 (*Cotesia flavipes*)+TX、菜蛾绒茧蜂 (*Cotesia plutellae*)+TX、孟氏隐唇瓢虫 (*Cryptolaemus montrouzieri*) (**Cryptobug®**+TX、**Cryptoline®**)+TX、日本方头甲 (*Cybocephalus nipponicus*)+TX、西伯利亚离颚茧蜂 (*Dacnusa sibirica*)+TX、西伯利亚离颚茧蜂 (*Dacnusa sibirica*) (**Minusa®**)+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂 (*Diglyphus isaea*) (**Diminex®**)+TX、小黑瓢虫 (*Delphastus catalinae*) (**Delphastus®**)+TX、*Delphastus pusillus*+TX、*Diachasmimorpha krausii*+TX、长尾潜蝇茧蜂 (*Diachasmimorpha longicaudata*)+TX、*Diaparsis jucunda*+TX、阿里食虱跳小蜂 (*Diaphorencyrtus aligarhensis*)+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂 (*Diglyphus isaea*)+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂 (*Diglyphus isaea*) (**Miglyphus®**+TX、**Digline®**)+TX、西伯利亚离颚茧蜂 (*Dacnusa sibirica*) (**DacDigline®**+TX、**Minex®**)+TX、歧脉跳小蜂属物种 (*Diversinervus* spp.)+TX、盾蚧长缨蚜小蜂 (*Encarsia citrina*)+TX、丽蚜小蜂 (*Encarsia formosa*) (*Encarsia max®*+TX、**Encarline®**+TX、**En-Strip®**)+TX、浆角蚜小蜂 (*Eretmocerus eremicus*) (**Enermix®**)+TX、哥德恩蚜小蜂 (*Encarsia guadeloupeae*)+TX、海地恩蚜小蜂 (*Encarsia haitiensis*)+TX、细扁食蚜蝇 (*Episyrphus*

balteatus) (**Syrphidend®**)+TX、Eretmoceris siphonini+TX、加州浆角蚜小蜂 (Eretmoceris californicus)+TX、浆角蚜小蜂 (Eretmoceris eremicus) (**Ercal®**)+TX、Eretline **e®**)+TX、浆角蚜小蜂 (**Bemimix®**)+TX、海氏浆角蚜小蜂 (Eretmoceris hayati)+TX、蒙氏浆角蚜小蜂 (Eretmoceris mundus) (**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 (Feltiella acarisuga) (**Feltiline®**)+TX、阿里山潜蝇茧蜂 (Fopius arisanus)+TX、Fopius ceratitivorus+TX、芒柄花黄素 (Formononetin) (Wirless **Beehome®**)+TX、细腰凶蓟马 (Franklinothrips vespiformis) (**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 (Habrobracon hebetor)+TX、异色瓢虫 (Harmonia axyridis) (**HarmoBeetle®**)+TX、异小杆线虫属 (Heterorhabditis spp.) (Lawn **Patrol®**)+TX、嗜菌异小杆线虫 (Heterorhabditis bacteriophora) (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 (Lbalia leucospoides)+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 (Lucilia caesar) (**Natufly®**)+TX、茶足柄瘤蚜茧蜂 (Lysiphlebus testaceipes)+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 (Micromus angulatus) (**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 (Neoseiulus californicus)+TX、瓜钝绥螨 (Neoseiulus cucumeris) (**THRYPEX®**)+TX、虚伪新小绥螨 (Neoseiulus fallacis)+TX、Nesideocoris tenuis (**NesidioBug®**)+TX、**Nesibug®**)+TX、古铜黑蝇 (Ophyra aenescens) (**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 (*Orius strigicollis*) (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 (*Phytoseiulus persimilis*) (**Spidex**®)+TX、*Phytoline p*®)+TX、斑腹刺益蝽 (*Podisus maculiventris*) (**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 (*Psyllaepagus pilosus*)+TX、同色短背茧蜂 (*Psytalia concolor*) (complex)+TX、胯姬小蜂属物种 (*Quadrastichus* spp.)+TX、*Rhyzobius lophanthae*+TX、澳洲瓢虫 (*Rodolia cardinalis*)+TX、*Rumina decollate*+TX、*Semielacher petiolatus*+TX、麦长管蚜 (*Sitobion avenae*) (**Ervibank**®)+TX、小卷蛾斯氏线虫 (*Steinernema carpocapsae*) (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、**BioNem F**®)+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、**BioNem L**®)+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、斯氏线虫属物种 (*Steinernema* spp.)+TX、*Steinernematid*属物种 (**Guardian Nematodes**®)+TX、深点食螨瓢虫 (*Stethorus punctillum*) (**Stethorus**®)+TX、亮腹釉小蜂 (*Tamarixia radiata*)+TX、*Tetrastichus setifer*+TX、*Thripobius semiluteus*+TX、中华长尾小蜂 (*Torymus sinensis*)+TX、甘蓝夜蛾赤眼蜂 (*Trichogramma brassicae*) (*Tricholine b*®)+TX、甘蓝夜蛾赤眼蜂 (*Trichogramma brassicae*) (*Tricho-Strip*®)+TX、广赤眼蜂 (*Trichogramma evanescens*)+TX、微小赤眼蜂 (*Trichogramma minutum*)+TX、玉米螟赤眼蜂 (*Trichogramma ostrinae*)+TX、宽脉赤眼蜂 (*Trichogramma platneri*)+TX、短管赤眼蜂 (*Trichogramma pretiosum*)+TX、螟黑点瘤姬蜂 (*Xanthopimpla stemmator*) ;

[1035] 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 (**Cueva**®)+TX、 δ 捕捉物 (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、漏斗捕捉物 (Funnel trap) (*Trapline y*®)+TX、**Gallex**®)+TX、*Grower's Secret*®)+TX、高油菜素内酯 (*Homo-brassonolide*)+TX、磷酸铁 (*Lilly Miller Worry Free Ferramol Slug&Snail Bait*®)+TX、MCP冰雹捕捉物 (hail trap) (*Trapline f*®)+TX、寄生性昆虫南美食甲茧蜂 (*Microctonus hyperodae*)+TX、*Mycoleptodiscus terrestris* (**Des-X**®)+TX、**BioGain**®)+TX、

Aminomite®+TX、**Zenox®**+TX、信息素罗网(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、粘捕捉物(Trapline **YF®**+TX、Rebell **Amarillo®**)+TX以及捕捉物(Takitrapline y+**b®**)+TX;

[1036] (1)选自以下的组的抗细菌剂:

[1037] (1.1)细菌,其实例为摩加夫芽孢杆菌(*Bacillus mojavensis*)菌株R3B(登记号NCAIM(P)B001389)(WO 2013/034938),来自三井物产株式会社(Mitsui&Co.)的子公司瑟缙丝美国公司(Certis USA LLC)+TX;短小芽孢杆菌,特别是菌株BU F-33,具有NRRL登记号50185(可作为**CARTISSA®**产品的部分从巴斯夫公司(BASF)获得,EPA登记号71840-19)+TX;枯草芽孢杆菌,特别是菌株QST713/AQ713(可作为来自美国的拜耳作物科学公司(Bayer CropScience LP)的SERENADE OPTI或SERENADE ASO获得,具有NRRL登记号B21661,美国专利号6,060,051)+TX;枯草芽孢杆菌菌株BU1814,(可作为**VELONDIS®**PLUS、**VELONDIS®**FLEX和**VELONDIS®**EXTRA从巴斯夫公司(BASF SE)获得)+TX;枯草芽孢杆菌变种解淀粉菌株FZB24,具有登记号DSM 10271(可作为**TAEGRO®**或**TAEGRO®**ECO(EPA登记号70127-5)从诺维信公司(Novozymes)获得)+TX;枯草芽孢杆菌CX-9060,来自三井物产株式会社的子公司瑟缙丝美国公司+TX;芽孢杆菌属物种,特别是菌株D747(可作为**DOUBLE NICKEL®**从组合化学工业株式会社(Kumiai Chemical Industry Co.,Ltd.)获得),具有登记号FERM BP-8234,美国专利号7,094,592+TX;类芽孢杆菌属物种菌株,具有登记号NRRL B-50972或登记号NRRL B-67129,WO 2016/154297+TX;多粘类芽孢杆菌,特别是菌株AC-1(例如,来自绿色生物技术有限公司(Green Biotech Company Ltd.)的**TOPSEED®**)+TX;成团泛菌,特别是菌株E325(登记号NRRL B-21856)(可作为BLOOMTIME BIOLOGICAL™FD BIOPESTICIDE从西北农产品公司(Northwest Agri Products)获得)+TX;普罗拉迪克斯假单胞菌(*Pseudomonas proradix*)(例如,来自索控帕德纳公司(Sourcon Padena)的**PRORADIX®**)+TX;和

[1038] (1.2)真菌,其实例为出芽短梗霉菌,特别是菌株DSM14940的芽生孢子、菌株DSM 14941的芽生孢子或菌株DSM14940和DSM14941的芽生孢子的混合物(例如,来自瑞士的百奥-菲牧公司(bio-ferm)的**BOTECTOR®**和**BLOSSOM PROTECT®**)+TX;蚜虫拟酵母菌(*Pseudozyma aphidis*)(如耶路撒冷希伯来大学伊森姆研究发展有限公司(Yissum Research Development Company of the Hebrew University of Jerusalem)在WO2011/151819中所披露的)+TX;酿酒酵母(*Saccharomyces cerevisiae*),特别是来自法国的乐斯福公司(Lesaffre et Compagnie)的菌株CNCM号1-3936、CNCM号1-3937、CNCM号1-3938或CNCM号1-3939(WO 2010/086790);

[1039] (2)选自以下的组的生物杀真菌剂:

[1040] (2.1)细菌,其实例为放射形土壤杆菌菌株K84(例如来自加利福尼亚州的艾格生物化学公司(AgBioChem)的**GALLTROL-A®**)+TX;放射形土壤杆菌菌株K1026(例如来自巴斯夫公司的**NOGALL™**)+TX;枯草芽孢杆菌变种解淀粉菌株FZB24,具有登记号DSM 10271(可作

为**TAEGRO®**或**TAEGRO®** ECO (EPA登记号70127-5)从诺维信公司(Novozymes)获得)+TX;解淀粉芽孢杆菌,特别是菌株D747(可作为Double Nickel™从组合化学工业株式会社获得,具有登记号FERM BP-8234,美国专利号7,094,592)+TX;解淀粉芽孢杆菌菌株F727(也称为菌株MBI110)(NRRL登记号B-50768,WO 2014/028521)(来自马罗尼生物创新公司(Marrone Bio Innovations)的**STARGUS®**)+TX;解淀粉芽孢杆菌菌株FZB42,登记号DSM 23117,(可作为**RHIZOVITAL®**从德国的艾比泰普公司(ABiTEP)获得)+TX;解淀粉芽孢杆菌分离物B246(例如,来自比勒陀利亚大学(University of Pretoria)的AVOGREEN™)+TX;地衣芽孢杆菌,特别是菌株SB3086,具有登记号ATCC 55406,WO 2003/000051(可作为**ECOGUARD®**生物杀真菌剂和GREEN RELEASE™从诺维信公司和获得)+TX+TX;地衣芽孢杆菌FMCH001和枯草芽孢杆菌FMCH002(来自FMC公司的**QUARTZO®**(WG)和**PRESENCE®**(WP))+TX;甲基营养型芽孢杆菌(*Bacillus methylotrophicus*)菌株BAC-9912(来自中国科学院应用生态研究所)+TX;摩加夫芽孢杆菌(*Bacillus mojavensis*)菌株R3B(登记号NCAIM(P)B001389)(WO 2013/034938),来自三井物产株式会社的子公司瑟缇丝美国公司+TX;蕈状芽孢杆菌分离物,具有登记号B-30890(可作为BMJ**TGAI®**或WG和LifeGard™从三井物产株式会社的子公司瑟缇丝美国公司的获得)+TX;短小芽孢杆菌,特别是菌株QST2808(可作为**SONATA®**从美国的拜耳作物科学公司获得,具有登记号NRRL B-30087并且描述于美国专利号6,245,551中)+TX;短小芽孢杆菌,特别是菌株GB34(可作为Yield**Shield®**从德国的拜耳公司(Bayer AG)获得)+TX;短小芽孢杆菌,特别是菌株BU F-33,具有NRRL登记号50185(可作为CARTISSA产品的部分从巴斯夫公司(BASF)获得,EPA登记号71840-19)+TX;枯草芽孢杆菌,特别是菌株QST713/AQ713(可作为SERENADE OPTI或SERENADE ASO从美国的拜耳作物科学公司(Bayer CropScience LP)获得,具有NRRL登记号B21661,并且描述于美国专利号6,060,051中)+TX;枯草芽孢杆菌Y1336(可作为**BIOBAC®**WP从中国台湾的百泰公司(Bion-Tech)获得,作为生物杀真菌剂在中国台湾登记在登记号4764、5454、5096和5277下)+TX;枯草芽孢杆菌菌株MBI 600(可作为SUBTILEX从巴斯夫公司获得,具有登记号NRRL B-50595,美国专利号5,061,495)+TX;枯草芽孢杆菌菌株GB03(可作为**Kodiak®**从德国的拜耳公司获得)+TX;枯草芽孢杆菌菌株BU1814,(可作为**VELONDIS®**PLUS、**VELONDIS®**FLEX和**VELONDIS®**EXTRA从巴斯夫公司获得)+TX;枯草芽孢杆菌CX-9060,来自三井物产株式会社的子公司瑟缇丝美国公司+TX;枯草芽孢杆菌KTSB菌株(来自唐纳吉公司(Donaghys)的**FOLIACTIVE®**)+TX;枯草芽孢杆菌IAB/BS03(来自斯托克顿生物-农业技术公司(STK Bio-Ag Technologies)的AVIV™、来自艾戴自然公司(Idai Nature)的**PORTENTO®**)+TX;枯草芽孢杆菌菌株Y1336(可作为**BIOBAC®**WP从中国台湾的百泰公司获得,作为生物杀真菌剂在中国台湾登记在登记号4764、5454、5096和5277下)+TX;附生类芽孢杆菌(*Paenibacillus epiphyticus*)(WO 2016/020371),来自巴斯夫公司+TX;多粘类芽孢杆菌植物属物种(WO 2016/020371),来自巴斯夫公司+TX;类芽孢杆菌属物种菌株,具有登记号NRRL B-50972或登记号NRRL B-67129,WO 2016/154297+TX;绿针假单胞菌菌株AFS009,具有登记号NRRL B-50897,WO 2017/019448(例如,来自美国的农业生物群落创新公司(AgBiome Innovations)

的HOWLER™和**ZIO®**)+TX;绿针假单胞菌菌株,特别是菌株MA342(例如,来自百圭公司(Bioagri)和科伯特(Koppert)公司的**CEDOMON®**、**CERALL®**、和**CEDRESS®**)+TX;荧光假单胞菌菌株A506(例如,来自新农公司(NuFarm)的**BLIGHTBAN®**A506)+TX;普罗拉迪克斯假单胞菌(*Pseudomonas proradix*)(例如,来自索控帕德纳公司的**PRORADIX®**)+TX;灰绿链霉菌(*Streptomyces griseoviridis*)菌株K61(也称为鲜黄链霉菌菌株K61)(登记号DSM 7206)(来自瓦德拉公司(Verdera)的**MYCOSTOP®**、来自拜沃公司(BioWorks)的**PREFENCE®**,参见作物保护2006,25,468-475)+TX;利迪链霉菌(*Streptomyces lydicus*)菌株WYEC108(也称为利迪链霉菌(*Streptomyces lydicus*)菌株WYCD108US)(来自诺维信公司的ACTINO-**IRON®**和**ACTINOVATE®**)+TX;以及[1041] (2.2)真菌,其实例为白粉寄生孢,特别是菌株AQ 10(例如,来自因特拉化学生物意大利公司(IntrachemBio Italia)的**AQ 10®**)+TX;白粉寄生孢菌株AQ10,具有登记号CNCM 1-807(例如,来自因特拉化学生物意大利公司的**AQ 10®**)+TX;黄曲霉菌株NRRL 21882(作为来自先正达公司(Syngenta)/中国化工公司(ChemChina)的**AFLA-GUARD®**而已知的产品)+TX;出芽短梗霉菌,特别是菌株DSM14940的芽生孢子+TX;出芽短梗霉菌,特别是菌株DSM 14941的芽生孢子+TX;出芽短梗霉菌,特别是菌株DSM14940和DSM 14941的芽生孢子的混合物(例如,来自瑞士的百奥-菲牧公司的**Botector®**)+TX;角毛壳菌(*Chaetomium cupreum*)(登记号CABI 353812)(例如,来自农业生活公司(AgriLife)的**BIOKUPRUM™**)+TX;球毛壳菌(*Chaetomium globosum*)(可作为**RIVADIOM®**由莱威尔公司(Rivale)获得)+TX;枝状枝孢菌(*Cladosporium cladosporioides*),菌株H39,具有登记号CBS122244,US 2010/0291039(由瓦赫宁根研究基金会(Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoek))+TX;盾壳霉(*Coniothyrium minitans*),特别是菌株CON/M/91-8(登记号DSM9660,例如,来自拜耳作物科学生物公司(Bayer CropScience Biologics GmbH)的**Contans®**)+TX;微黄隐球菌(*Cryptococcus flavescens*),菌株3C(NRRL Y-50378), (B2.2.99)+TX;白秃指状霉(*Dactylaria candida*)+TX;迪洛弗丝芙拉阿洛配库里(*Dilophosphora alopecuri*)(可作为**TWIST FUNGUS®**获得)+TX;尖孢镰刀菌,菌株Fo47(可作为**FUSACLEAN®**由自然植物保护公司(Natural Plant Protection)获得)+TX;链孢粘帚霉(*Gliocladium catenulatum*)(同义词:链状粉红螺旋聚孢霉(*Clonostachys rosea* f. *catenulate*))菌株J1446(例如,来自拉曼公司(Lallemand)的**Prestop®**)+TX;粉红粘帚霉(*Gliocladium roseum*)(也称为粉红粘帚霉(*Clonostachys rosea*)),特别是来自辅加公司(Adjuvants Plus)的菌株321U、如Xue(Efficacy of *Clonostachys rosea* strain ACM941 and fungicide seed treatments for controlling the root rot complex of field pea[粉红粘帚霉菌株ACM941和杀真菌剂种子处理对控制豌豆根腐病复合体的功效],Can Jour Plant Sci[加拿大植物学报]83(3):519-524)中所披露的菌株ACM941、或菌株IK726(Jensen DF等人Development of a biocontrol agent for plant disease control with special emphasis on the near commercial fungal antagonist *Clonostachys rosea* strain' IK726'[特别强调近商业

的真菌拮抗剂粉红粘帚霉菌株‘IK726’的用于植物病害控制的生物控制剂的开发], Australas Plant Pathol.[澳大利亚植物病理学]2007,36:95-101)+TX;蜡蚧轮枝菌(*Lecanicillium lecanii*) (原称为蜡蚧轮枝菌(*Verticillium lecanii*))菌株KV01的分生孢子(例如,来自科伯特公司/爱利思达公司(Arysta)的**Vertalec®**)+TX;果生美极梅奇酵母(*Metschnikowia fructicola*),特别是菌株NRRL Y-30752,(B2.2.3)+TX;赭色小球壳孢菌(*Microsphaeropsis ochracea*)+TX;恶臭玫红真菌(*Muscodor roseus*),特别是菌株A3-5(登记号NRRL 30548)+TX;歧皱青霉(*Penicillium steckii*) (DSM 27859,WO 2015/067800)来自巴斯夫公司+TX;蠕形青霉(*Penicillium vermiculatum*)+TX;大伏革菌(*Phlebiopsis gigantea*)菌株VRA 1992(来自丹斯塔发酵公司(Danstar Ferment)的**ROTSTOP®C**)+TX;异常毕赤酵母,菌株WRL-076(NRRL Y-30842),美国专利号7,579,183+TX;絮状假酵母菌(*Pseudozyma flocculosa*),菌株PF-A22 UL(可作为**SPORODEX®L**从加利福尼亚州的植物产品公司(Plant Products Co.)获得)+TX;酿酒酵母(*Saccharomyces cerevisiae*),特别是菌株LAS02(来自农业酵母及其衍生物公司(Agro-Levures et Dérivés)),菌株LAS117细胞壁(来自乐斯福公司的**CEREVISANE®**、来自巴斯夫公司的**ROMEO®**),来自法国的乐斯福公司的菌株CNCM号1-3936、CNCM号1-3937、CNCM号1-3938、CNCM号1-3939(WO 2010/086790)+TX;新普利斯利姆拉诺桑尼弗(*Simplicillium lanosoniveum*)+TX;黄色篮状菌(*Talaromyces flavus*),菌株V117b+TX;粗枝木霉(*Trichoderma asperelloides*)JM41R(登记号NRRL B-50759)(来自巴斯夫公司的**TRICHOPLUS®**)+TX;棘孢木霉(*Trichoderma asperellum*),特别是菌株kd(例如,来自安德玛特生物控制公司(Andermatt Biocontrol)的T-Gro)+TX;棘孢木霉(*Trichoderma asperellum*),特别是菌株SKT-1,具有登记号FERM P-16510(例如,来自组合化学工业株式会社的ECO-**HOPE®**)、菌株T34(例如,来自西班牙的生物控制技术公司(Biocontrol Technologies S.L.)的T34)或来自意赛格公司(Isagro)的菌株ICC 012+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),特别是菌株SC1(具有登记号CBS 122089,WO 2009/116106和美国专利号8,431,120(来自农业生物制品公司(Bi-PA)))、菌株77B(来自安德玛特生物控制公司的T77)或菌株LU132(例如,来自阿格里牧技术有限公司(Agrimm Technologies Limited)的Sentinel)+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株CNCM 1-1237(例如,来自法国的阿格劳可辛公司(Agrauxine)的**Esquive®WP**)+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株号V08/002387+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株NMI号V08/002388+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株NMI号V08/002389+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株NMI号V08/002390+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株LC52(例如,来自阿格里牧技术有限公司的Tenet)+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株ATCC 20476(IMI 206040)+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株T11(IMI352941/CECT20498)+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株SKT-1(FERM P-16510),日本专利公布(小海公司(Kokai))11-253151A+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株SKT-2(FERM P-16511),日本专利公布(小海公司(Kokai))11-253151A+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株SKT-3(FERM P-17021),日本专利公布(小海公司(Kokai))11-253151A+TX;顶孢木霉(*Trichoderma*

fertile) (例如,来自巴斯夫公司的产品TrichoPlus)+TX;盖姆斯木霉(*Trichoderma gamsii*) (原绿色木霉),菌株ICC080(IMI CC 392151CABI,例如,来自阿格里拜尔索墨西哥公司(AGROBIOSOL DE MEXICO,S.A.DE C.V.)的BioDerma)+TX;盖姆斯木霉(*Trichoderma gamsii*) (原绿色木霉),菌株ICC 080(IMI CC 392151CABI) (可作为**BIODERMA®**从阿格里拜尔索墨西哥公司获得)+TX;钩状木霉(*Trichoderma harmatum*)+TX;钩状木霉(*Trichoderma harmatum*),具有登记号ATCC 28012+TX;哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*) 菌株T-22(例如,来自安德玛特生物控制公司或科伯特公司的Triatum-P)或菌株Cepa SimbT5(来自辛伯斯农业公司(Simbiose Agro))+TX;哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*)+TX;哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*)斜面(rifai)T39(例如来自美国的马克特信阿甘公司(Makhteshim)的**Trichodex®**)+TX;哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*),菌株ITEM 908(例如,来自科伯特公司的Triatum-P)+TX;哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*),菌株TH35(例如,来自麦康特尔公司(Mycontrol)的Root-Pro)+TX;哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*),菌株DB 103(可作为T-**GRO®**7456从达古塔特生物实验室(Dagutat Biolab)获得)+TX;多孢木霉(*Trichoderma polysporum*),菌株IMI 206039(例如,来自瑞典的BINAB生物创新公司(BINAB Bio-Innovation AB)的Binab TF WP)+TX;子座木霉(*Trichoderma stromaticum*),具有登记号Ts3550(例如,来自巴西的可可种植计划执行委员会(CEPLAC)的Tricovab)+TX;绿木霉(*Trichoderma virens*) (也称为绿粘帚霉(*Gliocladium virens*)),特别是菌株GL-21(例如,来自美国的瑟缙丝(Certis)公司的SoilGard)+TX;绿木霉(*Trichoderma virens*)菌株G-41,原称为绿粘帚霉(*Gliocladium virens*) (登记号ATCC 20906) (例如,来自美国的拜沃公司的**ROOTSHIELD®**PLUS WP和**TURFSHIELD®**PLUS WP)+TX;绿色木霉(*Trichoderma viride*),菌株TV1(例如,来自科伯特公司的Triatum-P)+TX;绿色木霉(*Trichoderma viride*),特别是菌株B35(Pietr等人,1993,Zesz.Nauk.A R w Szczecinie[什切青农业大学科学卷]161:125-137)+TX;棘孢木霉(*Trichoderma asperellum*) 菌株ICC 012(也称为哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*) ICC012) (具有登记号CABI CC IMI 392716)和盖姆斯木霉(*Trichoderma gamsii*) (原绿色木霉)菌株ICC 080(具有登记号IMI 392151)的混合物(例如来自意赛格美国公司的BIO-TAM™和来自阿格里拜尔索墨西哥公司的**BIODERMA®**)+TX;奥德曼细基格孢(*Ulocladium oudemansii*)菌株U3,具有登记号NM 99/06216(例如,来自新西兰的宝特锐曾公司(Botry-Zen Ltd)的BOTRY-**ZEN®**和来自拜沃公司的**BOTRYSTOP®**)+TX;白-黑轮枝菌(*Verticillium albo-atrum*) (原大丽轮枝菌(*V.dahliae*)),菌株WCS850,具有登记号WCS850,保藏在真菌培养中心局(Central Bureau for Fungi Cultures) (例如,由树木护理创新公司(Tree Care Innovations)的DUTCH**TRIG®**)+TX;厚垣轮枝孢菌(*Verticillium chlamydosporium*)+TX;

[1042] (3)选自以下的组的具有改善植物生长和/或植物健康效果的生物控制剂:

[1043] (3.1)细菌,其实例为巴西固氮螺菌(*Azospirillum brasilense*) (例如,来自可鲁公司(KALO, Inc.)的**VIGOR®**)+TX;生脂固氮螺菌(*Azospirillum lipoferum*) (例如,来自特拉麦克斯公司(TerraMax, Inc.)的VERTEX-IF™)+TX;茎瘤固氮根瘤菌(*Azorhizobium caulinodans*),特别是菌株ZB-SK-5+TX;圆褐固氮菌(*Azotobacter chroococcum*),特别是

菌株H23+TX;棕色固氮菌 (*Azotobacter vinelandii*),特别是菌株ATCC 12837+TX;棕色固氮菌 (*Azotobacter vinelandii*) 和巴氏芽孢梭菌 (*Clostridium pasteurianum*) 的混合物 (可作为 **INVIGORATE®** 从阿坤纳斯公司 (Agrinos) 获得)+TX;解淀粉芽孢杆菌pm414 (来自生物膜作物保护公司 (Biofilm Crop Protection) 的LOLI-**PEPTA®**)+TX;解淀粉芽孢杆菌SB3281 (ATCC#PTA-7542,WO 2017/205258)+TX;解淀粉芽孢杆菌TJ1000 (可作为 **QUIKROOTS®** 从诺维信公司获得)+TX;解淀粉芽孢杆菌,特别是菌株IN937a+TX;解淀粉芽孢杆菌,特别是菌株FZB42 (例如,来自德国的艾比泰普公司的 **RHIZOVITAL®**)+TX;解淀粉芽孢杆菌BS27 (登记号NRRL B-5015)+TX;蜡样芽孢杆菌科成员EE128 (NRRL号B-50917)+TX;蜡样芽孢杆菌科成员EE349 (NRRL号B-50928)+TX;蜡样芽孢杆菌,特别是菌株BP01 (ATCC 55675,例如,来自美国的爱利思达生命科学公司 (Arysta Lifescience) 的 **MEPICHLOR®**)+TX;坚强芽孢杆菌,特别是菌株CNMC 1-1582 (例如,来自巴斯夫公司的 **VOTIVO®**)+TX;蕈状芽孢杆菌BT155 (NRRL号B-50921)+TX;蕈状芽孢杆菌EE118 (NRRL号B-50918)+TX;蕈状芽孢杆菌EE141 (NRRL号B-50916)+TX;蕈状芽孢杆菌BT46-3 (NRRL号B-50922)+TX;短小芽孢杆菌,特别是菌株QST2808 (具有登记号NRRL号B-30087)+TX;短小芽孢杆菌,特别是菌株GB34 (例如,来自德国的拜耳作物科学公司的 **YIELD SHIELD®**)+TX;暹罗芽孢杆菌 (*Bacillus siamensis*),特别是菌株KCTC 13613T+TX;枯草芽孢杆菌,特别是菌株QST713/AQ713 (具有NRRL登记号B-21661并且描述于美国专利号6,060,051中,可作为 **SERENADE® OPTI** 或 **SERENADE® ASO** 从美国的拜耳作物科学公司获得)+TX;枯草芽孢杆菌,特别是菌株AQ30002 (具有登记号NRRL B-50421并且描述于美国专利申请号13/330,576中)+TX;枯草芽孢杆菌,特别是菌株AQ30004 (以及NRRL B-50455并且描述于美国专利申请号13/330,576中)+TX;枯草芽孢杆菌菌株BU1814 (可作为 **TEQUALIS®** 从巴斯夫公司获得)、枯草芽孢杆菌rm303 (来自生物膜作物保护公司的 **RHIZOMAX®**)+TX;苏云金芽孢杆菌BT013A (NRRL号B-50924),也称为苏云金芽孢杆菌4Q7+TX;地衣芽孢杆菌FMCH001和枯草芽孢杆菌FMCH002的混合物 (可作为 **QUARTZO® (WG)**、**PRESENCE® (WP)** 从FMC公司获得)+TX;枯草芽孢杆菌,特别是菌株MBI 600 (例如,来自巴斯夫公司的 **SUBTILEX®**)+TX;特基拉芽孢杆菌 (*Bacillus tequilensis*),特别是菌株NII-0943+TX;大豆慢生型根瘤菌 (*Bradyrhizobium japonicum*) (例如,来自诺维信公司的 **OPTIMIZE®**)+TX;食酸戴尔福特菌 (*Delftia acidovorans*),特别是菌株RAY209 (例如,来自布雷特氧种子子公司 (Brett Young Seeds) 的 **BIOBOOST®**)+TX;鹰嘴豆中间根瘤菌 (*Mesorhizobium cicer*) (例如,来自巴斯夫公司的 **NODULATOR**)+TX;乳杆菌属物种 (例如,来自拉特帕菲公司 (LactoPAFI) 的 **LACTOPLANT®**)+TX;豆科根瘤菌 (*Rhizobium leguminosarium* biovar *viciae*) (例如,来自巴斯夫公司的 **NODULATOR**)+TX;普罗拉迪克斯假单胞菌 (*Pseudomonas proradix*) (例如,来自索控帕德纳公司的 **PRORADIX®**)+TX;铜绿假单胞菌,特别是菌株PN1+TX;豆科根瘤菌 (*Rhizobium leguminosarum*),特别是蚕豆根瘤菌 (*bv. viceae*) 菌株Z25 (登记号CECT 4585)+TX;多粘类芽孢杆菌,特别是菌株AC-1 (例如,来自绿色生物技术有限公司的 **TOPSEED®**)+TX;粘

质沙雷氏菌(*Serratia marcescens*),特别是菌株SRM(登记号MTCC 8708)+TX;苜蓿中华根瘤菌(*Sinorhizobium meliloti*)菌株NRG-185-1(来自拜耳作物科学公司的**NITRAGIN®** GOLD)+TX;硫杆菌属物种(*Thiobacillus* sp.) (例如,来自英国的克劳普埃德公司(Cropaid Ltd)的**CROPAID®**)+TX;以及

[1044] (3.2) 真菌,其实例为淡紫字胞菌(*Purpureocillium lilacinum*) (曾称为淡紫拟青霉(*Paecilomyces lilacinus*))菌株251(AGAL 89/030550,例如,来自拜耳作物科学生物公司的BioAct)+TX;拜赖青霉(*Penicillium bilaii*),菌株ATCC 22348(例如,来自阿克塞尔隆生物农业公司(Acceleron BioAg)的**JumpStart®**)、黄色篮状菌(*Talaromyces flavu*),菌株V117b+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*)菌株CNCM 1-1237(例如,来自法国的阿格劳可辛公司的**Esquive®**WP)、绿色木霉(*Trichoderma viride*),例如菌株B35(Pietr等人,1993,Zesz.Nauk.A R w Szczecinie[什切青农业大学科学卷]161:125-137)+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*)菌株LC52(也称为深绿木霉(*Trichoderma atroviride*)菌株LU132,例如,来自阿格里牧技术有限公司的Sentinel)+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*)菌株SC1(描述于国际申请号PCT/IT2008/000196中)+TX;棘孢木霉(*Trichoderma asperellum*)菌株kd(例如,来自安德玛特生物控制公司的T-Gro)+TX;棘孢木霉(*Trichoderma asperellum*)菌株Eco-T(新西兰的植物健康产品公司)、哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*)菌株T-22(例如,来自安德玛特生物控制公司或科伯特公司的Triatum-P)+TX;疣孢漆斑菌菌株AARC-0255(例如,来自华仑生物科学公司(Valent Biosciences)的DiTera™)+TX;拜赖青霉(*Penicillium bilaii*)菌株ATCC ATCC20851+TX;侧雄腐霉菌(*Pythium oligandrum*)菌株M1(ATCC 38472,例如,来自捷克的拜奥普雷普罗迪公司(Bioprepraty)的Polyversum)+TX;绿木霉(*Trichoderma virens*)菌株GL-21(例如,来自美国的瑟缙丝公司的**SoilGard®**)+TX;白-黑轮枝菌(*Verticillium albo-atrum*) (原大丽轮枝菌(*V.dahliae*))菌株WCS850(CBS 276.92,例如,来自树木护理创新公司的Dutch Trig)+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),特别是菌株号V08/002387、菌株号NMI号V08/002388、菌株号NMI号V08/002389、菌株号NMI号V08/002390+TX;哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*)菌株ITEM 908、哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*)菌株TSTh20+TX;哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*)菌株1295-22+TX;侧雄腐霉菌(*Pythium oligandrum*)菌株DV74+TX;阿米尔氏须腹菌(*Rhizopogon amylopogon*) (例如,包含在来自海伦娜化学公司(Helena Chemical Company)的Myco-Sol中)+TX;富尔维氏须腹菌(*Rhizopogon fulvigleba*) (例如,包含在来自海伦娜化学公司的Myco-Sol中)+TX;绿木霉(*Trichoderma virens*)菌株GI-3+TX;

[1045] (4) 选自以下的杀昆虫活性生物控制剂

[1046] (4.1) 细菌,其实例为放射形杆菌菌株K84(来自艾格生物化学公司的Galltrol)+TX;解淀粉芽孢杆菌,特别是菌株PTS-4838(例如,来自美国的华仑生物科学公司的AVEO)+TX;坚强芽孢杆菌,特别是菌株CNMC 1-1582(例如,来自巴斯夫公司的**VOTIVO®**)+TX;蕈状芽孢杆菌分离物J.(例如,来自三井物产株式会社的子公司瑟缙丝美国公司的BmJ)+TX;球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus*),特别是血清型H5a5b菌株2362(菌株ABTS-1743)(例如,来自美国的华仑生物科学公司的**VECTOLEX®**)+TX;苏云金芽孢杆菌鲎泽亚

种 (subsp. aizawai), 特别是菌株 ABTS-1857 (SD-1372, 例如, 来自华仑生物科学公司的 **XENTARI®**) +TX; 苏云金芽孢杆菌 鲎泽亚种 (subsp. aizawai), 特别是血清型 H-7 (例如, 来自美国的华仑生物科学公司的 **FLORBAC®** WG) +TX; 苏云金芽孢杆菌 以色列 (Bacillus thuringiensis israelensis) 菌株 BMP 144 (例如, 来自伊利诺伊州的贝克尔微生物产品公司 (Becker Microbial Products) 的 **AQUABAC®**) +TX; 苏云金芽孢杆菌 以色列亚种 (subsp. israelensis) (血清型 H-14) 菌株 AM65-52 (登记号 ATCC 1276) (例如, 来自美国的华仑生物科学公司的 **VECTOBAC®**) +TX; 苏云金芽孢杆菌 鲎泽亚种 (subsp. aizawai) 菌株 GC-91+TX; 苏云金芽孢杆菌 科尔默变种 (var. Colmeri) (例如, 来自常州市江海化工公司 (Changzhou Jianghai Chemical Factory) 的 TIANBAOBT) +TX; 苏云金芽孢杆菌 日本变种 菌株 Buibui+TX; 苏云金芽孢杆菌 库尔斯塔克亚种 (subsp. kurstaki) 菌株 BMP 123, 来自伊利诺伊州的贝克尔微生物产品公司+TX; 苏云金芽孢杆菌 库尔斯塔克亚种 (Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki) 菌株 BMP 123 (来自伊利诺伊州的贝克尔微生物产品公司), 例如, 来自拜耳作物科学公司的 BARITONE+TX; 苏云金芽孢杆菌 库尔斯塔克亚种 (subsp. kurstaki) 菌株 HD-1 (例如, 来自美国的华仑生物科学公司的 **DIPEL®** ES) +TX; 苏云金芽孢杆菌 库尔斯塔克变种 菌株 EVB-113-19 (例如, 来自 AEF 全球公司 (AEF Global) 的 **BIOPROTEC®**) +TX; 苏云金芽孢杆菌 库尔斯塔克亚种 (subsp. kurstaki) 菌株 ABTS 351 +TX; 苏云金芽孢杆菌 库尔斯塔克亚种 (subsp. kurstaki) 菌株 PB 54+TX; 苏云金芽孢杆菌 库尔斯塔克亚种 (subsp. kurstaki) 菌株 SA 11, (来自美国的瑟缙丝公司的 JAVELIN) +TX; 苏云金芽孢杆菌 库尔斯塔克亚种 (subsp. kurstaki) 菌株 SA 12 (来自美国的瑟缙丝公司的 THURICIDE) +TX; 苏云金芽孢杆菌 库尔斯塔克亚种 (subsp. kurstaki) 菌株 EG 2348 (来自美国的瑟缙丝公司的 LEPINOX) +TX; 苏云金芽孢杆菌 库尔斯塔克亚种 (subsp. kurstaki) 菌株 EG 7841 (来自美国的瑟缙丝公司的 CRYMAX) +TX; 苏云金芽孢杆菌 拟步行甲亚种 (subsp. tenebrionis) 菌株 NB 176 (SD-5428, 例如, 来自德国的拜奥法公司 (BioFa) 的 **NOVODOR®** FC) +TX; 侧孢芽孢杆菌 (Brevibacillus laterosporus) (来自易克利布瑞姆生物公司 (Ecolibrium Biologicals) 的 LATERAL) +TX; 伯克霍尔德里菌属物种, 特别是里诺肯斯伯克霍尔德里菌 (Burkholderia rinojensis) 菌株 A396 (也称为里诺肯斯伯克霍尔德里菌 (Burkholderia rinojensis) 菌株 MBI 305) (登记号 NRRL B-50319+TX; WO 2011/106491 和 WO 2013/032693+TX; 例如, 来自马罗尼生物创新公司的 MBI206 TGAI 和 **ZELTO®**) +TX; 铁杉紫色杆菌 (Chromobacterium subtsugae), 特别是菌株 PRAA4-1T (MBI-203+TX; 例如, 来自马罗尼生物创新公司的 **GRANDEVO®**) +TX; 蝇蚧疥霉 (Lecanicillium muscarium) Ve6 (来自科伯特公司的 MYCOTAL) +TX; 日本金龟子类芽孢杆菌 (Paenibacillus popilliae) (原日本金龟子芽孢杆菌 (Bacillus popilliae) +TX; 例如来自圣加布里埃尔实验室 (St. Gabriel Laboratories) 的 MILKY SPORE POWDER™ 和 MILKY SPORE GRANULAR™) +TX; 拟斯扎瓦巴氏杆菌菌株 Pn1 (来自先正达公司/中国化工公司的 CLARIVA) +TX; Serratia entomophila (e.g. **INVADE®** by Wrightson Seeds) +TX; 粘质沙雷氏菌 (Serratia marcescens), 特别是菌株 SRM (登记号 MTCC 8708) +TX; 棘孢木霉 (Trichoderma asperellum) (来自诺维信公司的 TRICHODERMAX) +TX; 毕梯斯沃巴契亚体 (Wolbachia pipientis) ZAP 菌株 (例如, 来自莫斯科托梅特公司 (MosquitoMate) 的 ZAP **MALES®**) +

TX;以及

[1047] (4.2) 真菌,其实例为球孢白僵菌(*Beauveria bassiana*)菌株ATCC 74040(例如,来自因特拉化学生物意大利公司的**NATURALIS®**)+TX;球孢白僵菌(*Beauveria bassiana*)菌株GHA(登记号ATCC74250,例如,来自拉弗莱姆国际公司(Laverlam International Corporation)的**BOTANIGUARD®ES**和**MYCONTROL-®**)+TX;球孢白僵菌(*Beauveria bassiana*)菌株ATP02(登记号DSM 24665)+TX;玫烟色棒束孢(*Isaria fumosorosea*)(曾称为玫烟色拟青霉)菌株Apopka97,来自赛普洛公司(SePRO)的PREFERAL+TX;绿僵菌3213-1(保藏在NRRL登记号67074下)(WO 2017/066094+TX;先锋良种国际公司(Pioneer Hi-Bred International))+TX;罗伯茨绿僵菌(*Metarhizium robertsii*)15013-1(保藏在NRRL登记号67073下)+TX;罗伯茨绿僵菌(*Metarhizium robertsii*)23013-3(保藏在NRRL登记号67075下)+TX;淡紫色拟青霉菌株251(来自美国的瑟缇丝公司的MELOCON)+TX;拉迪肯虫瘟霉(*Zoopthora radicans*)+TX;

[1048] (5) 选自由以下组成的组的病毒:棉褐带卷蛾(苹果小卷蛾(summer fruit tortrix))颗粒体病毒(GV)+TX;苹果蠹蛾(*Cydia pomonella*/codling moth)颗粒体病毒(GV)+TX;棉铃虫(*Helicoverpa armigera*/cotton bollworm)核型多角体病毒(NPV)+TX;甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua*/beet armyworm)mNPV+TX;草地贪夜蛾(秋夜蛾)mNPV+TX;海灰翅夜蛾(非洲棉叶蛾)NPV+TX;

[1049] (6) 可以被作为“接种剂”添加至植物或植物部分或植物器官、并且由于其特定特性而促进植物生长和植物健康的选自以下的细菌和真菌:土壤杆菌属物种(*Agrobacterium* spp.)+TX;茎瘤固氮根瘤菌(*Azorhizobium caulinodans*)+TX;固氮螺菌属物种+TX;固氮菌属物种+TX;慢生型根瘤菌属物种+TX;伯克霍尔德菌属物种(*Burkholderia* spp.),特别是洋葱伯克霍尔德菌(*Burkholderia cepacia*)(原称为洋葱假单胞菌)+TX;巨孢囊霉属物种或单孢巨孢囊霉(*Gigaspora monosporum*)+TX;球囊霉属物种(*Glomus* spp.)+TX;蜡蘑属物种(*Laccaria* spp.)+TX;布氏乳杆菌(*LactoBacillus buchneri*)+TX;类球囊霉属物种(*Paraglomus* spp.)+TX;采色豆马勃(*Pisolithus tinctorus*)+TX;假单胞菌属物种+TX;根瘤菌属物种,特别是三叶草根瘤菌(*Rhizobium trifolii*)+TX;须腹菌属物种(*Rhizopogon* spp.)+TX;硬皮马勃属物种(*Scleroderma* spp.)+TX;乳牛肝菌属物种(*Suillus* spp.)+TX;链霉菌属物种+TX;

[1050] (7) 可用作生物控制剂的植物提取物和由微生物形成的产物(包括蛋白质和次生代谢物),其选自大蒜(*Allium sativum*)(来自艾科斯普瑞公司(Eco-Spray)的NEMGUARD+TX;来自安道麦公司(ADAMA)的BRALIC)+TX;Armour-Zen+TX;苦艾(*Artemisia absinthium*)+TX;印楝素(例如,来自美国的瑟缇丝公司的AZATIN XL)+TX;Biokeeper WP+TX;十字花科(Brassicaceae)提取物,特别是油菜粉或芥菜粉+TX;黑决明子(*Cassia nigricans*)+TX;苦皮藤(*Celastrus angulatus*)+TX;美洲土荆芥(*Chenopodium anthelminticum*)+TX;几丁质(Chitin)+TX;欧洲鳞毛蕨(*Dryopteris filix-mas*)+TX;问荆(*Equisetum arvense*)+TX;Fortune Aza+TX;Fungastop+TX;Heads Up(藜麦皂苷(*Chenopodium quinoa saponin*)提取物)+TX;PROBLAD(来自羽扇豆种子的天然Blad多肽),瑟缇丝欧洲公司+TX;FRACTURE(来自羽扇豆种子的天然Blad多肽),FMC公司+TX;除虫菊(Pyrethrum)/除虫菊酯(Pyrethrins)+TX;苏里南苦木(*Quassia amara*)+TX;栎(*Quercus*)+TX;皂树(*Quillaja*)提取物(来自巴斯

夫公司的QL AGRI 35)+TX;大虎杖提取物(来自马罗尼生物公司(Marrone Bio)的REGALLIA/REGALIA MAXX)+TX;“RequiemTM杀昆虫剂”+TX;鱼藤酮+TX;鱼尼丁(ryania)/兰尼碱(ryanodine)+TX;聚合草(Symphytum officinale)+TX;菊蒿+TX;百里酚(Thymol)+TX;与香叶醇(Geraniol)混合的百里酚(Thymol)(来自伊甸研究公司(Eden Research)的CEDROZ)+TX;与香叶醇(Geraniol)和丁子香酚(Eugenol)混合的百里酚(Thymol)(来自伊甸研究公司的MEVALONE)+TX;Triact 70+TX;TriCon+TX;旱金莲(Tropaeolum majus)+TX;互叶白千层提取物(Melaleuca alternifolia)(来自斯托克顿公司(STK)的TIMOREX GOLD)+TX;大荨麻(Urtica dioica)+TX;藜芦碱(Veratrin)+TX;和白槲寄生(Viscum album)+TX;以及

[1051] 安全剂,如解草啉+TX、解草酯(包括解草酯-甲基)+TX、环丙磺酰胺+TX、二氯丙烯胺+TX、解草啞(包括解草啞-乙基)+TX、解草啞+TX、氟草肟+TX、解草噁啞+TX、双苯噁啞酸(包括双苯噁啞酸-乙基)+TX、吡啞解草酯(mefenpyr)(包括吡啞解草酯-二乙基)+TX、metcamifen+TX和解草脞+TX。

[1052] 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。在活性成分包括在“The Pesticide Manual[杀有害生物剂手册]”[The Pesticide Manual-A World 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]]中的情况下,它们在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“阿维菌素”以条目编号(1)来描述。在“[CCN]”在上文添加到特定化合物的情况下,所述的化合物包括在“Compendium of Pesticide Common Names[杀有害生物剂通用名纲要]”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“乙酰虫脞”描述于互联网地址<http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>中。

[1053] 多数上述活性成分在上文中通过所谓的“通用名”来提及,在单个情形中使用相应的“ISO通用名”或另一“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。

[1054] 选自表A-1至A-60、表B-1至B-60、表C-1至C-60、表D-1至D-60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A-1至A-60、表B-1至B-60、表C-1至C-60、表D-1至D-60和表P的化合物和如上所述的活性成分,这些化合物和这些活性成分优选地处于从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,甚至更尤其是从10:1至1:10,非常尤其是从5:1和1:5的比率,特别优选的从2:1至1:2的比率,并且同样优选的是从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。

[1055] 如上所述的混合物可以被用于控制有害生物的方法中,该方法包括将包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。

[1056] 包含选自表A-1至A-60、表B-1至B-60、表C-1至C-60、表D-1至D-60和表P的具有式I的化合物和一种或多种如上所述的活性成分的混合物可以例如如下施用：以单一的“掺水即用”的形式，以组合式喷雾混合物（该混合物由单一活性成分组分的单独配制品构成，例如“桶混剂”），以及当以顺序方式（即，一个在另一个适度短的时间段之后，如几小时或几天）施用组合使用这些单一活性成分。施用选自表A-1至A-60、表B-1至B-60、表C-1至C-60、表D-1至D-60和表P的具有式I的化合物和如上文所述的活性成分的顺序对于实施本发明并不是至关重要的。

[1057] 根据本发明的组合物还可以包含另外的固体或液体助剂，如稳定剂，例如未环氧化的或环氧化的植物油（例如环氧化的椰子油、菜籽油或大豆油），消泡剂（例如硅酮油），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。

[1058] 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。

[1059] 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的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。每公顷的施用比率总体上是每公顷1g至2000g活性成分、特别是10g/ha至1000g/ha、优选地是10g/ha至600g/ha。

[1060] 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（叶施用），可能的是选择施用的频率和比率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场所浸透或者通过将呈固体形式的活性成分引入植物的场所（例如引入土壤，例如以颗粒的形式（土施））来实现的。在水稻作物的情况下，这样的颗粒剂可以被计量地加入淹水的稻田中。

[1061] 本发明的化合物及其组合物还适合于植物繁殖材料（例如种子，如果实、块茎或籽粒，或者苗圃植物）的保护，以对抗上述类型的有害生物。可以用该化合物在种植前对该繁殖材料进行处理，例如可以在播种前对种子进行处理。可替代地，该化合物可以施用至种子籽粒（包衣），这是通过将籽粒浸渍入液体组合物中或通过施用固体组合物层实现的。还可能在该繁殖材料被种植在施用场地时施用这些组合物，例如在条播期间将这些组合物施入种子犁沟。这些用于植物繁殖材料的处理方法和如此处理的植物繁殖材料是本发明另外的主题。典型的处理比率将取决于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。

[1062] 术语种子包括所有种类的种子以及植物繁殖体，包括但并不限于真正的种子、种子块、吸盘、谷粒、鳞球茎、果实、块茎、谷物、根茎、插条、切割枝条以及类似物并且在优选实施例中意指真正的种子。

[1063] 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。尽管取决于施用的方法成分的更多或更少的部分可以渗透到种子材料中，术语“用……包衣或处理和/或含有”通常表示在施用的时候，在大多数情况下，活性成分在种子的表面。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1中，本发明使得可获得其上粘附有具有式(I)的化合物的植物繁殖材料。此外，由此使得可获得包含用具有式(I)的化合物处理过的植物繁殖材料的组合物。

[1064] 种子处理包括本领域中已知的所有适合的种子处理技术，如拌种、种子包衣、种子撒粉、浸种以及种子造粒。可以通过任何已知的方法进行具有式(I)的化合物的种子处理施用，如在种子播种之前或播种/种植过程中对种子喷雾或撒粉。

[1065] 生物学实例：

[1066] 接下来的实例用来说明本发明。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比率下更大的功效，这可以由本领域技术人员使用在实例中概述的实验程序，使用更低的施用比率(如果必要的话)例如，50ppm、12.5ppm、6ppm、3ppm、1.5ppm、0.8ppm或0.2ppm来证实。

[1067] 实例B1：对抗烟粉虱(棉粉虱)的活性

[1068] 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6天之后，针对死亡率对这些样品进行检查。

[1069] 以下化合物在200ppm施用比率下产生至少80%的死亡率：P2、P3、P11、P12。

[1070] 实例B2：对抗二化螟(Chilo suppressalis)(水稻二化螟(Striped rice stemborer))的活性

[1071] 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(6-8只/孔)。侵染6天之后，相比于未处理样品，针对死亡率、拒食效果以及生长抑制对这些样品进行评估。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，实现测试样品对二化螟的控制。

[1072] 以下化合物在200ppm施用比率下产生至少80%的控制：P1、P2、P3、P4、P5、P6、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P18、P19、P20、P21、P22、P23、P24、P25、P26、P27、P29、P30、P31、P33。

[1073] 实例B3：对抗黄瓜条叶甲(玉米根虫)的活性

[1074] 将24孔微量滴定板中的置于琼脂层上的玉蜀黍芽通过喷雾用从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4天之后，相比于未处理样品，针对死亡率和生长抑制对这些样品进行评估。

[1075] 以下化合物在200ppm施用比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、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P19、P20、P21、P22、P23、P24、P25、P26、P27、P30、P31、P32、P33、P34、P35。

[1076] 实例B4：对抗英雄美洲蝽(Euschistus heros)(新热带褐臭蝽)的活性

[1077] 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N2期若虫对叶片进行侵染。侵染5天之后，相比于未处理样品，针对死亡率和生长抑制对这些样品进行评估。

[1078] 以下化合物在200ppm施用比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、P11、P12、P15、P20、P21、P22、P23、P24、P27、P33。

[1079] 实例B5:对西花蓟马(*Frankliniella occidentalis*) (西方花蓟马(*Western flower thrips*))的活性

[1080] 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。干燥之后,用混合年龄的花蓟马种群对叶圆片进行侵染。侵染7天之后,针对死亡率对这些样品进行评估。

[1081] 以下化合物在200ppm施用比率下产生至少80%的死亡率:P4。

[1082] 实例B6:对抗桃蚜(绿色桃蚜虫)摄食/接触活性

[1083] 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。干燥之后,用混合年龄的蚜虫种群对叶圆片进行侵染。侵染6天之后,针对死亡率对这些样品进行评估。

[1084] 以下化合物在200ppm施用比率下产生至少80%的死亡率:P1、P2、P3、P4、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P18、P20、P22、P24、P29、P34。

[1085] 实例B7:对抗桃蚜(绿桃蚜虫)的活性内吸活性

[1086] 将受到混合年龄的蚜虫种群侵染的豌豆幼苗的根部直接放在从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。

[1087] 以下化合物在24ppm测试比率下产生至少80%的死亡率:P1、P2、P8、P11、P12、P15、P18、P22、P34。

[1088] 实例B8:对抗小菜蛾(*Plutella xylostella*) (小菜蛾(*Diamond back moth*))的活性

[1089] 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,将菜蛾属卵吸移穿过塑料模板到凝胶印迹纸上并且用其封闭板。侵染8天之后,相比于未处理样品,针对死亡率和生长抑制对这些样品进行评估。

[1090] 以下化合物在200ppm施用比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、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P18、P19、P20、P21、P22、P23、P24、P25、P26、P27、P28、P29、P30、P31、P32、P34、P35。

[1091] 实例B9:对抗海灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis*) (埃及棉叶虫)的活性

[1092] 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3天之后,相比于未处理样品,针对死亡率、拒食效果以及生长抑制对这些样品进行评估。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。

[1093] 以下化合物在200ppm施用比率下产生至少80%的控制:P1、P2、P3、P4、P5、P6、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P18、P19、P20、P21、P22、P23、P24、P25、P27、P29、P30、P31、P32。

[1094] 实例B10:对抗二点叶螨(二斑叶螨)的活性

[1095] 将24孔微量滴定板中的琼脂上的大豆叶圆片用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。干燥之后,将叶圆片用混合年龄的螨种群进行侵染。在侵染之后8天,针对混合种群(活动阶段)的死亡率对这些样品进行评估。

[1096] 以下化合物在200ppm施用比率下产生至少80%的死亡率:P23。

[1097] 实例B11:对抗苹果蠹蛾(Carpocapsa (Cydia) pomonella) (苹果小卷蛾(Codling moth))活性(杀幼虫剂,摄食/接触)

[1098] 在施用室中用稀释的测试溶液对涂覆有石蜡的饮食立方体(Diet cube)进行喷洒。在干燥之后,将处理过的立方体(10个复制品)用1只L1期幼虫进行侵染。将样品在26°C-27°C下温育并且在侵染14天之后,针对死亡率和生长抑制进行检查。

[1099] 以下化合物在12.5ppm施用比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、P5、P9、P10、P11、P12、P14、P17、P19、P20、P21、P23、P24、P30、P31。

[1100] 实例B12:对抗褐飞虱(褐稻飞虱)的活性(杀幼虫剂,内吸进入水中)

[1101] 将在营养液中培养的水稻用经稀释的测试溶液处理成营养培养系统。在施用之后1天,用约20只N3期若虫对植物进行侵染。在侵染之后7天,针对死亡率和生长调节对样品进行评估。

[1102] 以下化合物在12.5ppm施用比率下产生至少80%的死亡率:P1、P2、P3、P9、P10、P11、P12、P14、P17、P19、P20、P23、P24、P30、P31。