



(21) 申請案號：108138065

(22) 申請日：中華民國 108 (2019) 年 10 月 22 日

(51) Int. Cl. : C07D471/04 (2006.01)
A01N43/90 (2006.01)

C07D487/04 (2006.01)

(30) 優先權：2018/10/24 印度 201811040165
2019/03/22 歐洲專利局 19164767.6(71) 申請人：瑞士商先正達農作物保護公司 (瑞士) SYNGENTA CROP PROTECTION AG (CH)
瑞士(72) 發明人：愛德門斯 安德魯 EDMUNDS, ANDREW (GB)；韓德勒 塞巴斯蒂安 RENDLER,
SEBASTIAN (DE)；席克維爾 維卡司 SIKERVAR, VIKAS (IN)；山恩 印迪拉
SEN, INDIRA (IN)；艾米瑞 丹尼 EMERY, DANIEL (CH)；慕勒巴哈 米歇爾
MUEHLEBACH, MICHEL (CH)；布賀胡茲 安格 BUCHHOLZ, ANKE (DE)

(74) 代理人：閻啓泰；林景郁

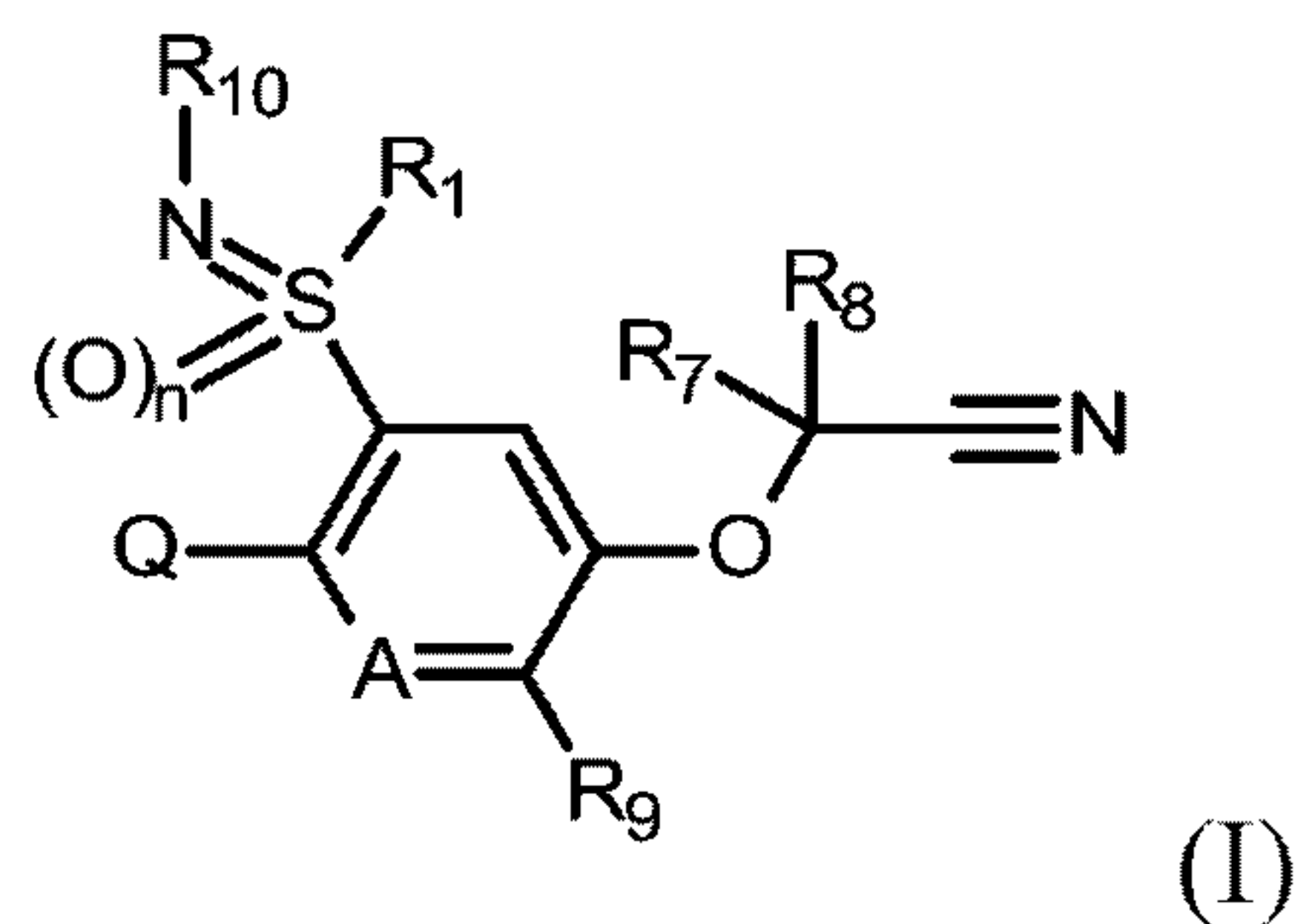
申請實體審查：無 申請專利範圍項數：20 項 圖式數：0 共 205 頁

(54) 名稱

具有含亞砷亞胺的取代基之殺有害生物活性雜環衍生物

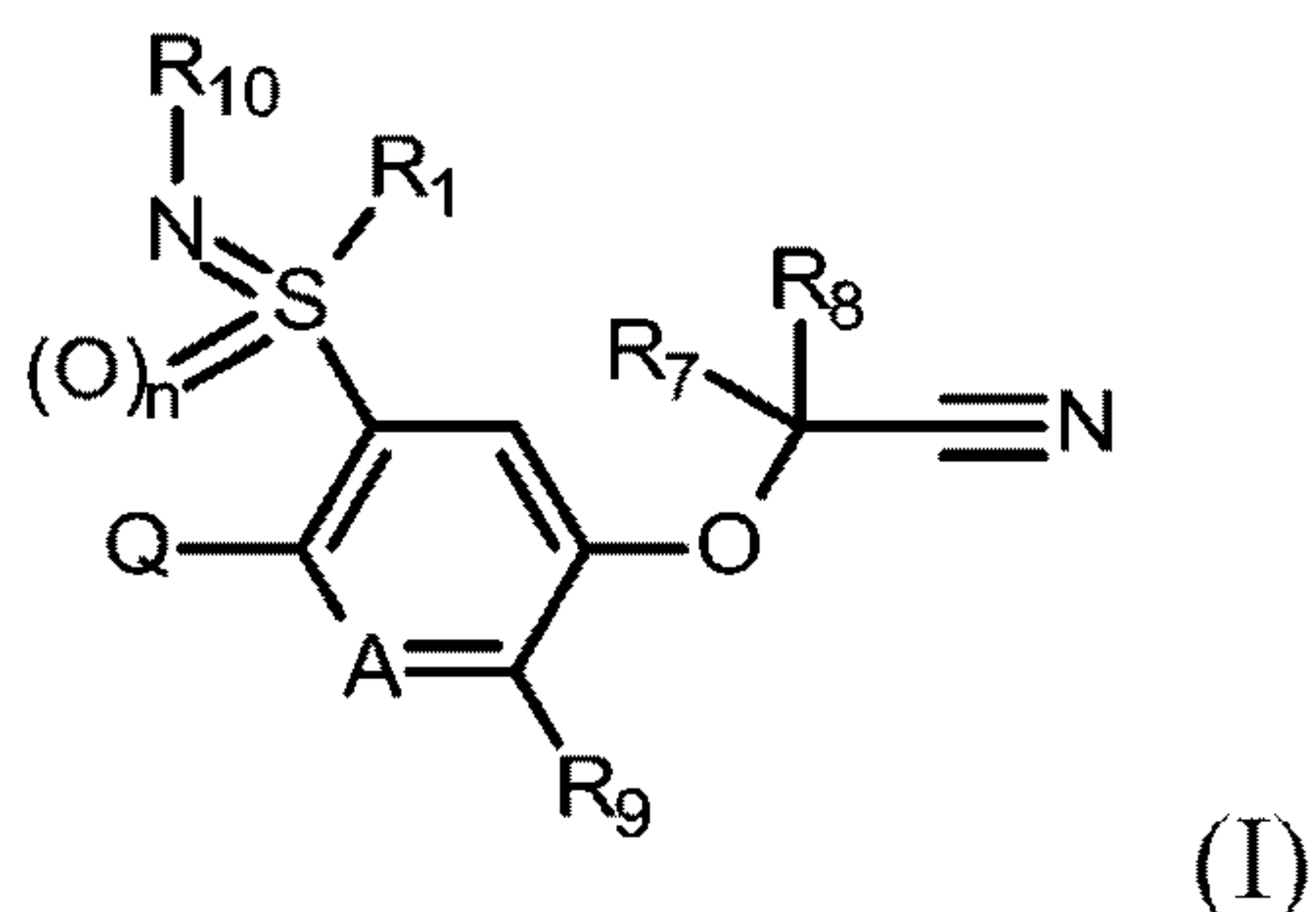
(57) 摘要

式 (I) 之化合物



其中取代基係如申請專利範圍第 1 項中所定義的。此外，本發明涉及包含式 (I) 之化合物的農用化學組成物，該等組成物之製備，以及該等化合物或組成物在農業或園藝中用於對抗、預防或防治包括節肢動物並且特別地昆蟲或蟎目 (Acarina) 的代表在內的動物有害生物之用途。

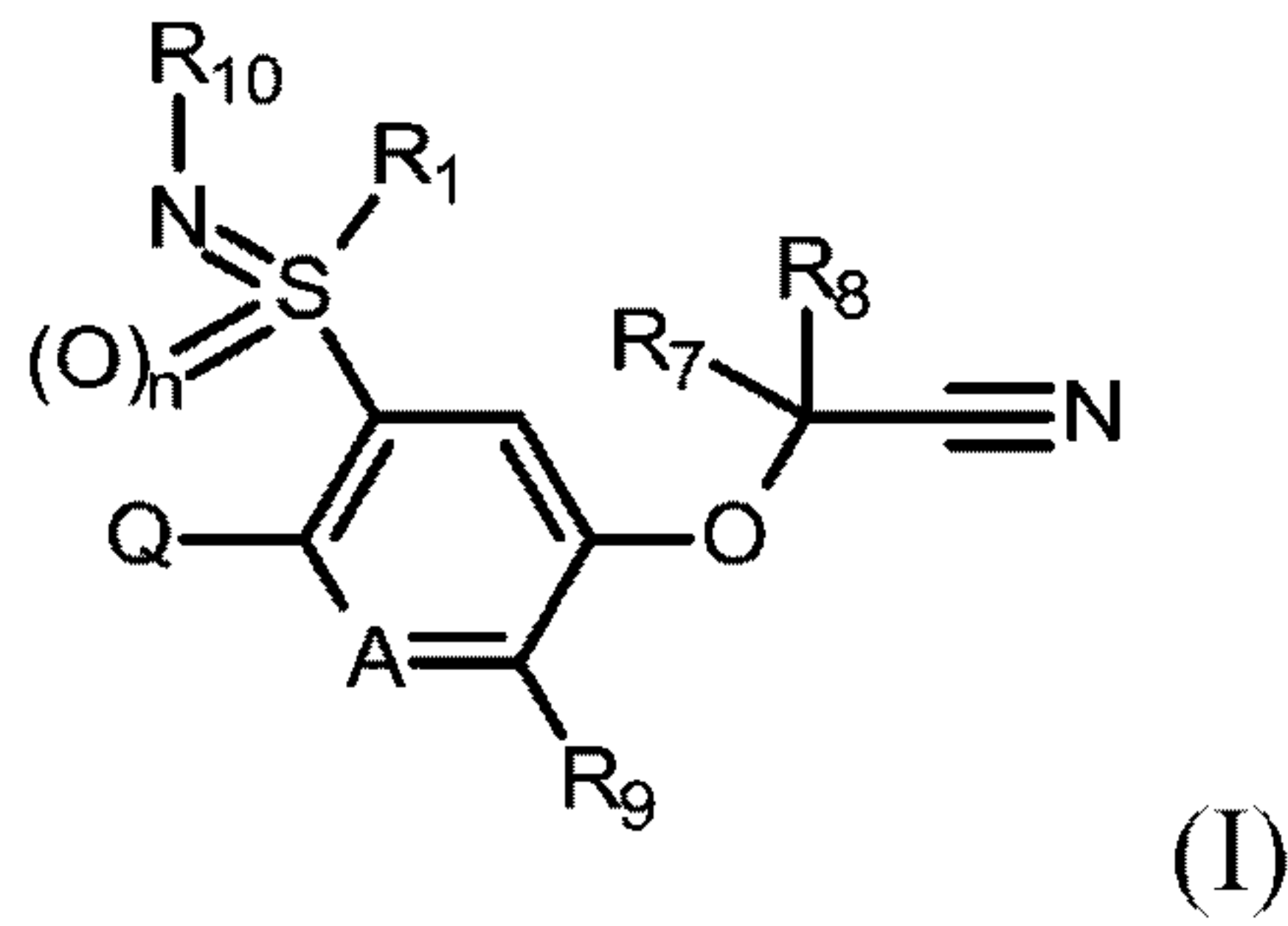
Compounds of the formula (I)



wherein the substituents are as defined in claim 1.

Furthermore, the present invention relates to agrochemical compositions which comprise compounds of formula (I), to preparation of these compositions, and to the use of the compounds or compositions in agriculture or horticulture for combating, preventing or controlling animal pests, including arthropods and in particular insects or representatives of the order Acarina.

特徵化學式：





202035404

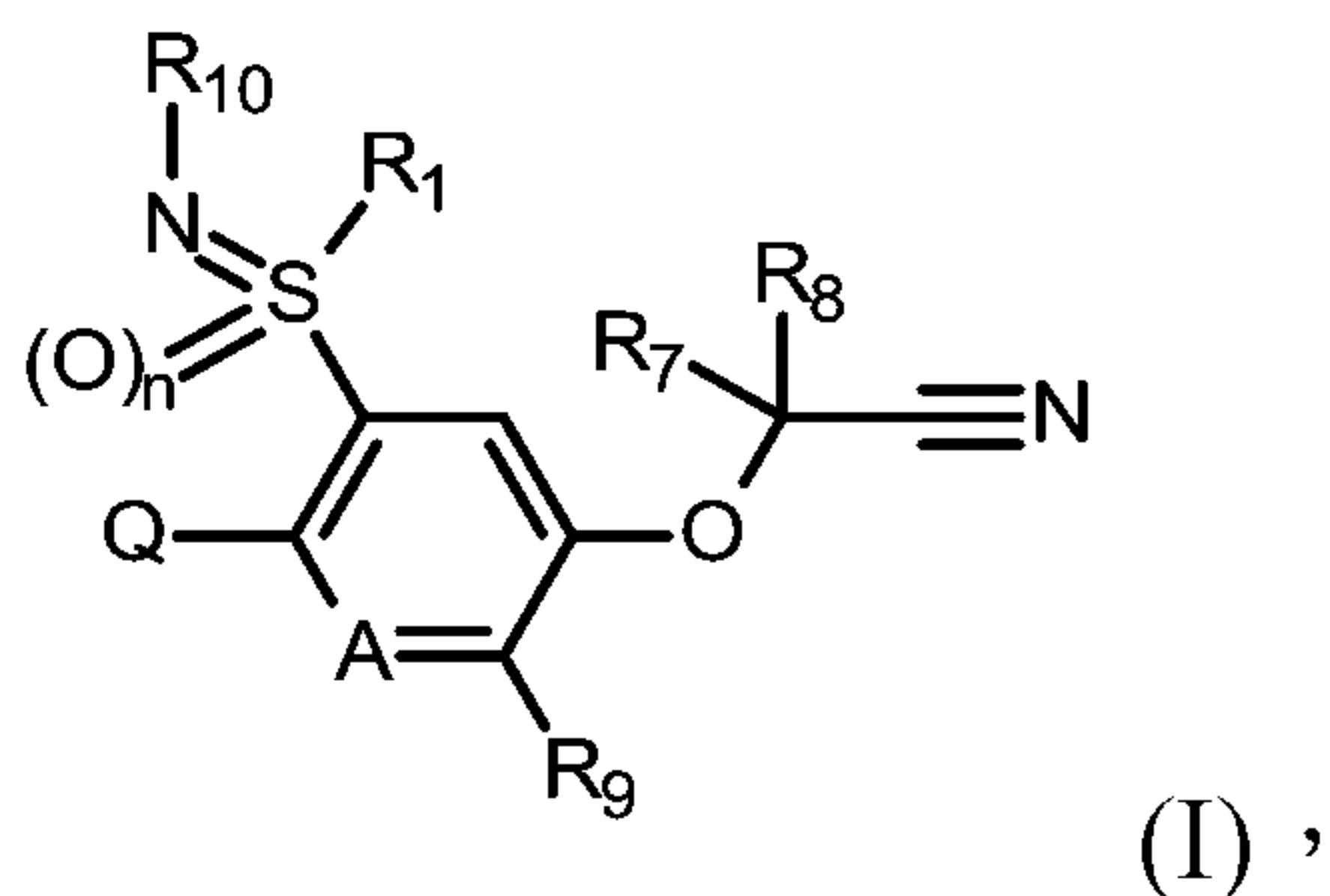
【發明摘要】

【中文發明名稱】 具有含亞磺亞胺的取代基之殺有害生物活性雜環衍生物

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

【中文】

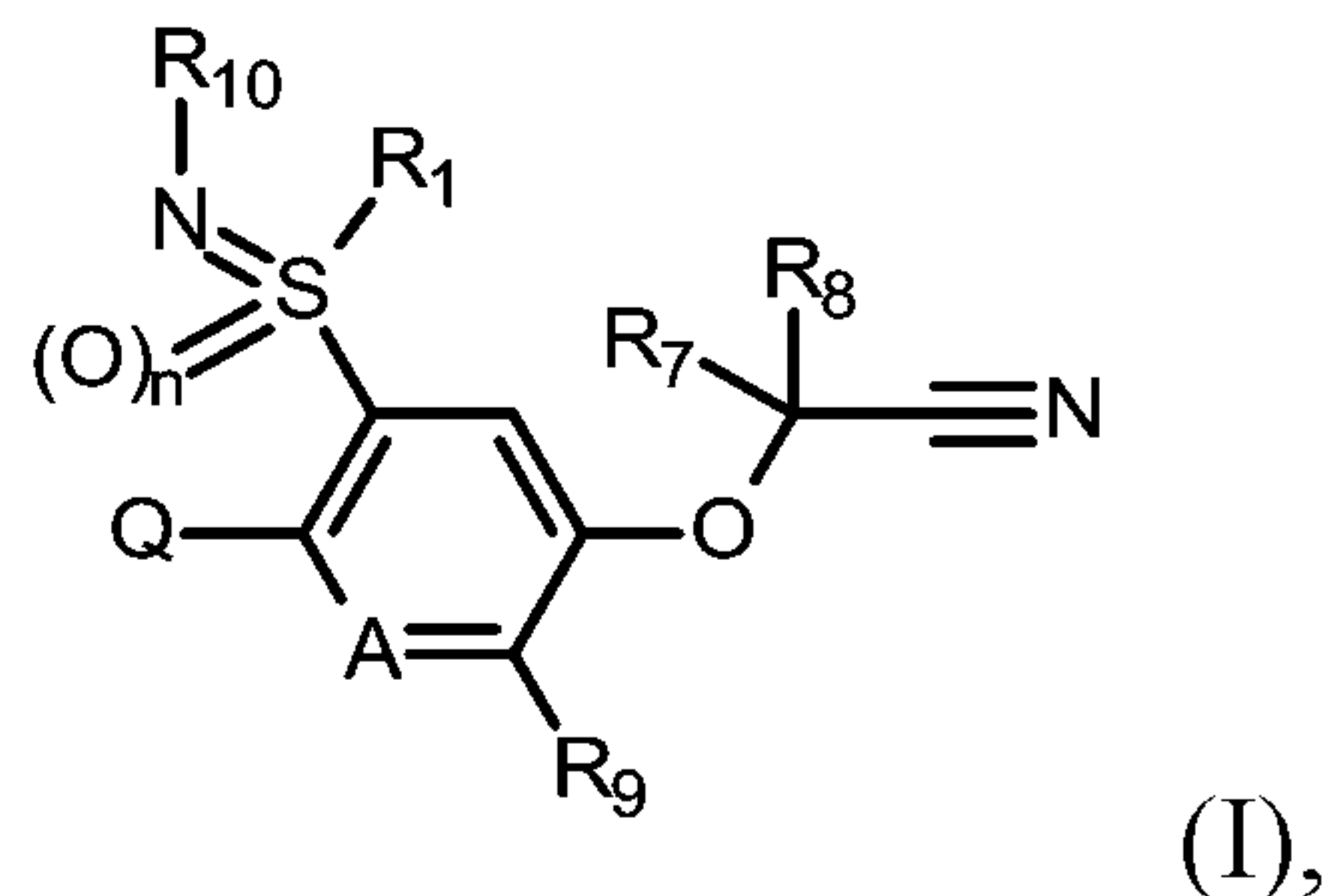
式 (I) 之化合物



其中取代基係如申請專利範圍第1項中所定義的。此外，本發明涉及包含式 (I) 之化合物的農用化學組成物，該等組成物之製備，以及該等化合物或組成物在農業或園藝中用於對抗、預防或防治包括節肢動物並且特別地昆蟲或蜱蟎目 (*Acarina*) 的代表在內的動物有害生物之用途。

【英文】

Compounds of the formula (I)



wherein the substituents are as defined in claim 1.

Furthermore, the present invention relates to agrochemical compositions which comprise compounds of formula (I), to preparation of these compositions, and to the

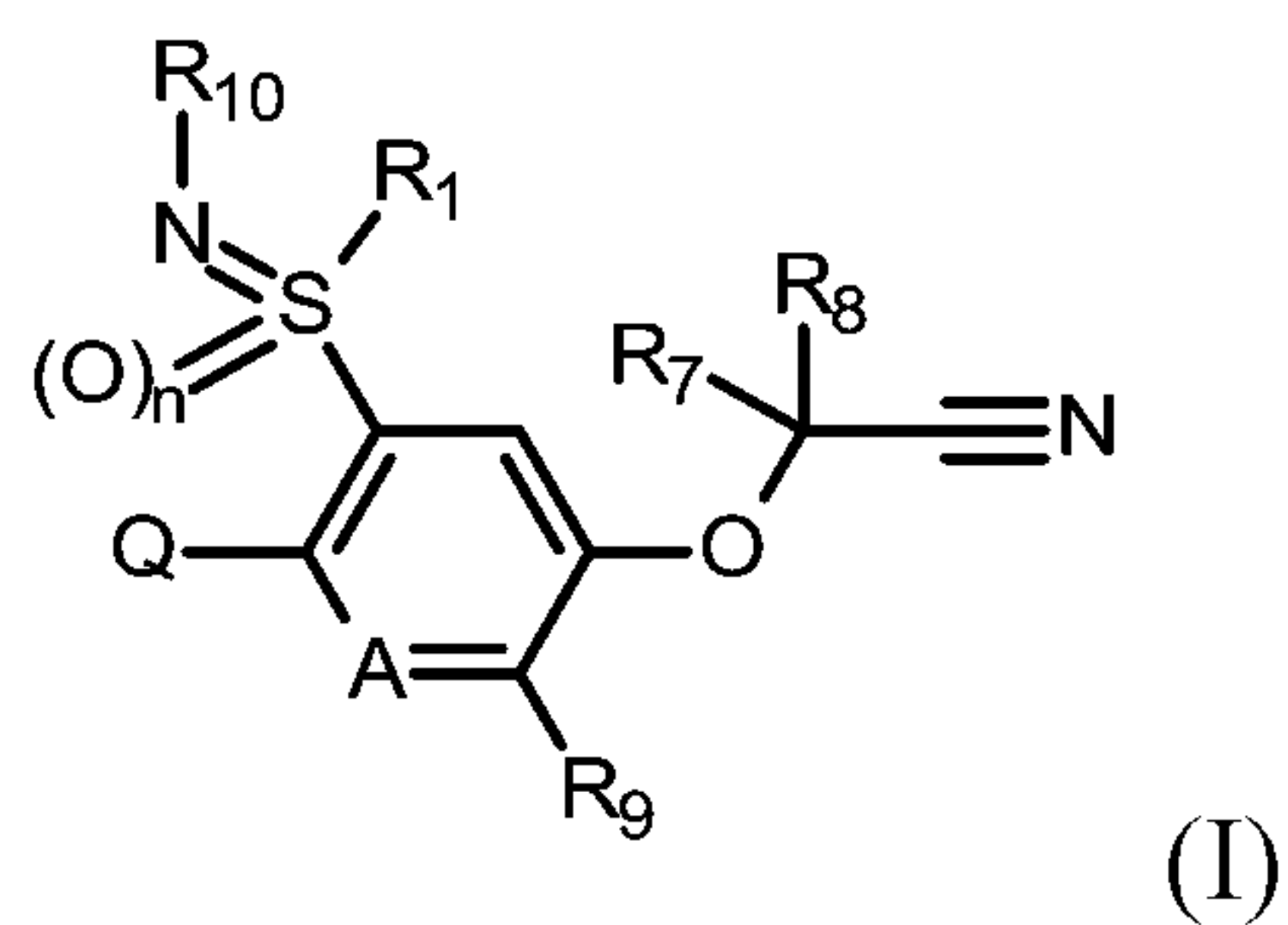
use of the compounds or compositions in agriculture or horticulture for combating, preventing or controlling animal pests, including arthropods and in particular insects or representatives of the order *Acarina*.

【指定代表圖】 無

【代表圖之符號簡單說明】

無

【特徵化學式】



【發明說明書】

【中文發明名稱】 具有含亞磺亞胺的取代基之殺有害生物活性雜環衍生物

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

【技術領域】

【0001】 本發明涉及含亞磺亞胺（sulfoximine）取代基的殺有害生物活性（特別是殺昆蟲活性）雜環衍生物、其製備方法、包含該等化合物的組成物、以及它們用於防治動物有害生物（包括節肢動物並且特別是昆蟲或蜱蟎目（*Acarina*）的代表）的用途。

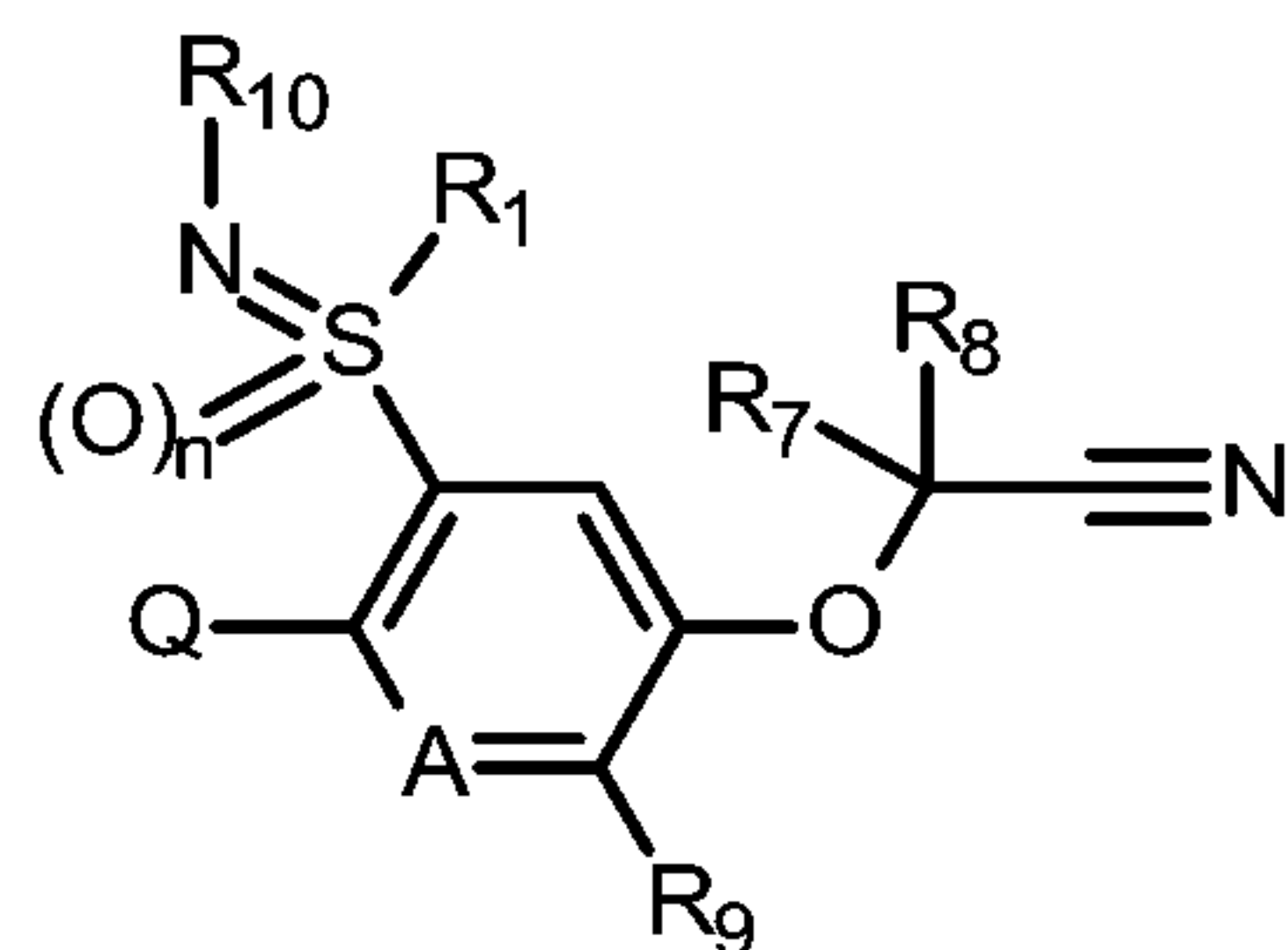
【先前技術】

【0002】 殺有害生物活性的雜環亞磺亞胺衍生物先前已描述在文獻中，例如在WO 2015/071180、WO 2018/206348和WO 2019/065568中。

【發明內容】

【0003】 現已出人意料地發現，某些具有氰基烷氧基的新型含亞磺亞胺的苯基和吡啶基衍生物具有作為殺有害生物劑的有利特性。

【0004】 因此本發明提供了式I的化合物，



(I)，

其中

A係CH或N；

R₁係C₁-C₄烷基；

R₇和R₈彼此獨立地是氫、鹵素或C₁-C₆烷基；

R₉係氫或C₁-C₄烷基；

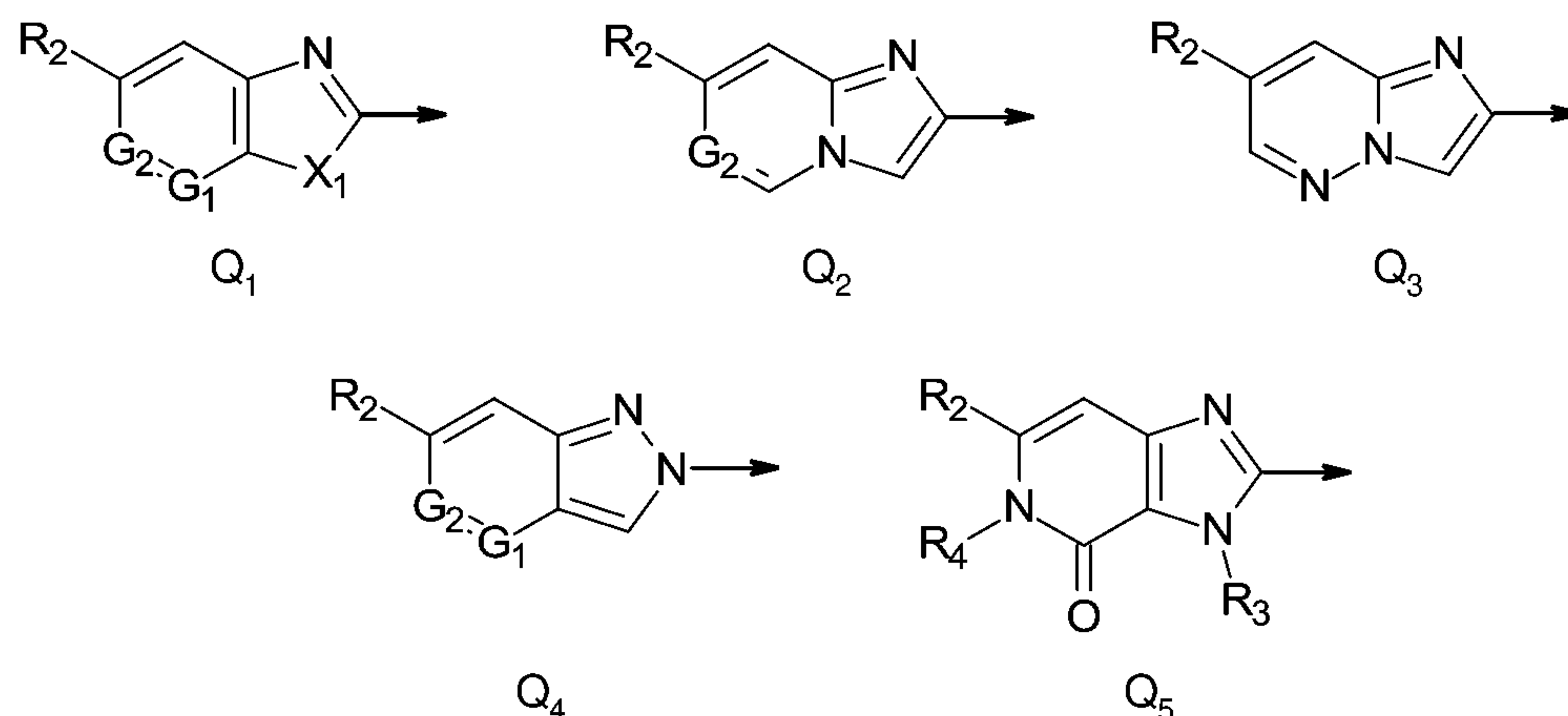
R₁₀係氫、氰基、-C(O)R₂₅、-C(O)OR₂₆或C₁-C₆烷基；

R₂₅係氫、C₁-C₆烷基或C₁-C₆鹵代烷基；

R₂₆係C₁-C₆烷基或C₁-C₆鹵代烷基；

n係0或1；

Q係選自以下群組的基團，該群組由以下各項組成：式Q₁至Q₅



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

X₁係O、S或NR₃；

R₃係C₁-C₄烷基；

R₂係鹵素、C₁-C₆鹵代烷基、C₁-C₄鹵代烷基氫硫基、C₁-C₄鹵代烷基亞磺醯基、C₁-C₄鹵代烷基磺醯基或C₁-C₆鹵代烷氧基；

G₁和G₂彼此獨立地是N或CH；

R₄係C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵代烷基、C₃-C₆環烷基或C₁-C₄烷氧基；和

該等式I的化合物的農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互

變異構物和N-氧化物。

【0005】 具有至少一個鹼性中心的式I的化合物可以例如與以下形成例如酸加成鹽：強無機酸（諸如礦物酸，例如過氯酸、硫酸、硝酸、亞硝酸（nitroic acid）、磷酸或氫鹵酸），強有機羧酸（諸如未取代的或例如被鹵素取代的C₁-C₄烷羧酸，例如乙酸；諸如飽和或不飽和的二羧酸，例如草酸、丙二酸、琥珀酸、馬來酸、富馬酸或鄰苯二甲酸；諸如羥基羧酸，例如抗壞血酸、乳酸、蘋果酸、酒石酸或檸檬酸；或諸如苯甲酸），或有機磺酸（諸如未取代的或例如被鹵素取代的C₁-C₄烷磺酸或芳基磺酸，例如甲烷磺酸或對甲苯磺酸）。具有至少一個酸性基團的式I的化合物可以例如與鹼形成鹽，例如礦物鹽，諸如鹼金屬或鹼土金屬鹽，例如鈉鹽、鉀鹽或鎂鹽；或與氨或有機胺（諸如咪啉，哌啶，吡咯啶，單、二或三低級烷基胺，例如乙胺、二乙胺、三乙胺或二甲基丙基胺，或單、二或三羥基低級烷基胺，例如單乙醇胺、二乙醇胺或三乙醇胺）形成鹽。

【0006】 在取代基定義中出現的烷基可以是直鏈的或支鏈的，並且是例如甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、二級丁基、異丁基、三級丁基、戊基、己基以及它們的支鏈異構物。烷基氫硫基、烷基亞磺基、烷基磺基和烷氧基衍生自所提及的烷基。

【0007】 鹵素通常是氟、氯、溴或碘。相應地，這還適用於與其他含義組合的鹵素，諸如鹵代烷基。

【0008】 鹵代烷基較佳的是具有從1至6個碳原子的鏈長。鹵代烷基係例如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、2,2,2-三氟乙基、2-氟乙基、2-氯乙基、五氟乙基、1,1-二氟-2,2,2-三氯乙基、2,2,3,3-四氟乙基和2,2,2-三氯乙基；較佳的是三氯甲基、二氟氯甲基、二氟甲基、三氟甲基和二氯氟甲基。

【0009】 烷氧基較佳的是具有從1至6個碳原子的較佳的鏈長。烷氧基係例

如甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、異丁氧基、二級丁氧基和三級丁氧基以及還有同分異構的戊氧基和己氧基；較佳的是甲氧基和乙氧基。

【0010】 烷氧基烷基較佳的是具有1至6個碳原子的鏈長，更較佳的是1至4個碳原子的鏈長。烷氧基烷基係例如甲氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基甲基、乙氧基乙基、正丙氧基甲基、正丙氧基乙基、異丙氧基甲基或異丙氧基乙基。

【0011】 烷基氫硫基係例如甲基氫硫基、乙基氫硫基、丙基氫硫基、異丙基氫硫基、丁基氫硫基、戊基氫硫基、和己基氫硫基。

【0012】 烷基亞磺醯基係例如甲基亞磺醯基、乙基亞磺醯基、丙基亞磺醯基、異丙基亞磺醯基、丁基亞磺醯基、戊基亞磺醯基、和己基亞磺醯基。

【0013】 烷基磺醯基係例如甲基磺醯基、乙基磺醯基、丙基磺醯基、異丙基磺醯基、丁基磺醯基、戊基磺醯基、和己基磺醯基。

【0014】 環烷基較佳的是具有從3至6個環碳原子，例如環丙基、環丁基、環戊基和環己基。

【0015】 鹵代烷基氫硫基較佳的是具有從1至4個碳原子的鏈長。鹵代烷基氫硫基係例如二氟甲基氫硫基、三氟甲基氫硫基或2,2,2-三氟乙基氫硫基。類似的考慮適用於基團C₁-C₄鹵代烷基亞磺醯基和C₁-C₄鹵代烷基磺醯基，其可以是例如三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基或2,2,2-三氟乙基磺醯基。

【0016】 根據本發明的式I的化合物還包括在鹽形成期間可能形成的水合物。

【0017】 如下所列，提供了根據本發明的實施方式。

【0018】 實施方式1提供了如上所定義的式I的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物。

【0019】 實施方式2提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係CH或N；

R₁係乙基、丙基或異丙基；

R₁₀係氫、氰基或-C(O)R₂₅，其中R₂₅係C₁-C₂鹵代烷基；

R₉係氫、甲基或乙基；並且

n係1。

【0020】 實施方式3a提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係CH或N；

R₁係乙基；

R₁₀係氫；

R₉係氫或甲基；並且

n係1。

【0021】 實施方式3b提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係N；

R₁係乙基；

R₁₀係氫；

R₉係氫或甲基；並且

n係1。

【0022】 實施方式4a提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係CH或N；

R₁係乙基；

R₁₀係氫；

R₉係氫；並且

n係1。

【0023】 實施方式4b提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係N；

R₁係乙基；

R₁₀係氫；

R₉係氫；並且

n係1。

【0024】 實施方式5a提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係CH或N；

R₁係乙基；

R₁₀係氫；

R₉係甲基；並且

n係1。

【0025】 實施方式5b提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係N；

R₁係乙基；

R₁₀係氫；

R₉係甲基；並且

n係1。

【0026】 實施方式6提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接

受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

R_7 係氫或 C_1 - C_4 烷基；並且 R_8 係 C_1 - C_4 烷基。

【0027】 實施方式7提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

R_7 係氫、甲基或乙基；並且 R_8 係甲基或乙基。

【0028】 實施方式8a提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

R_7 係甲基或乙基；並且 R_8 係甲基或乙基。

【0029】 實施方式8b提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

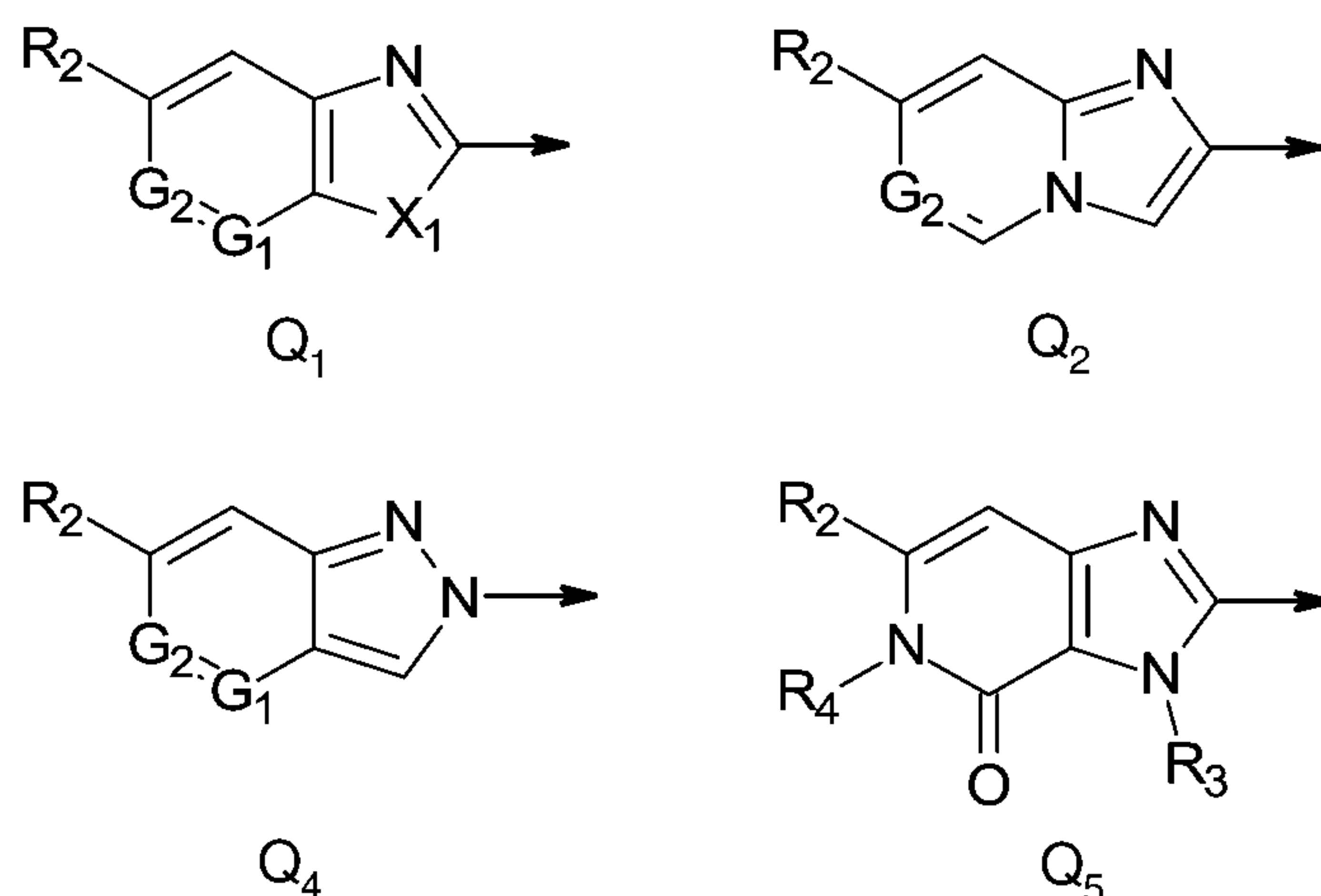
R_7 係甲基；並且 R_8 係甲基或乙基。

【0030】 實施方式8c提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

R_7 係甲基；並且 R_8 係甲基。

【0031】 實施方式9提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

Q係選自 Q_1 、 Q_2 、 Q_4 和 Q_5 的基團



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R_2 係 C_1 - C_2 鹵代烷基、 C_1 - C_2 鹵代烷基氫硫基、 C_1 - C_2 鹵代烷基亞磺醯基或 C_1 - C_2 鹵代烷基磺醯基；

X_1 係氧或 NCH_3 ；

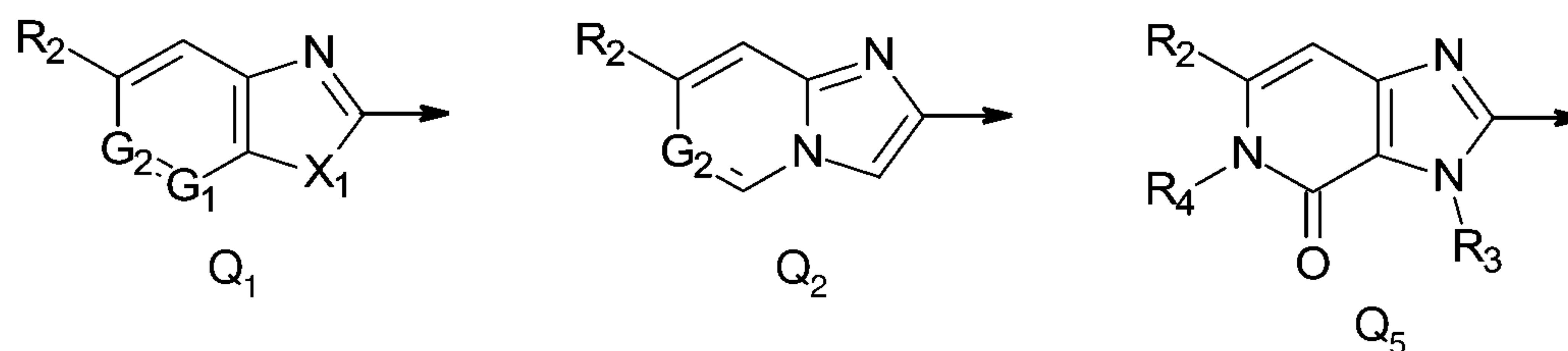
R_3 係 C_1 - C_2 烷基；

R_4 係 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵代烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或環丙基；並且

G_1 和 G_2 彼此獨立地是N或CH。

【0032】 實施方式10提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

Q係選自 Q_1 、 Q_2 和 Q_5 的基團



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R_2 係 C_1 - C_2 氟烷基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、二氟甲基氫硫基、二氟甲基亞磺醯基、或二氟甲基磺醯基；

X_1 係 NCH_3 ；

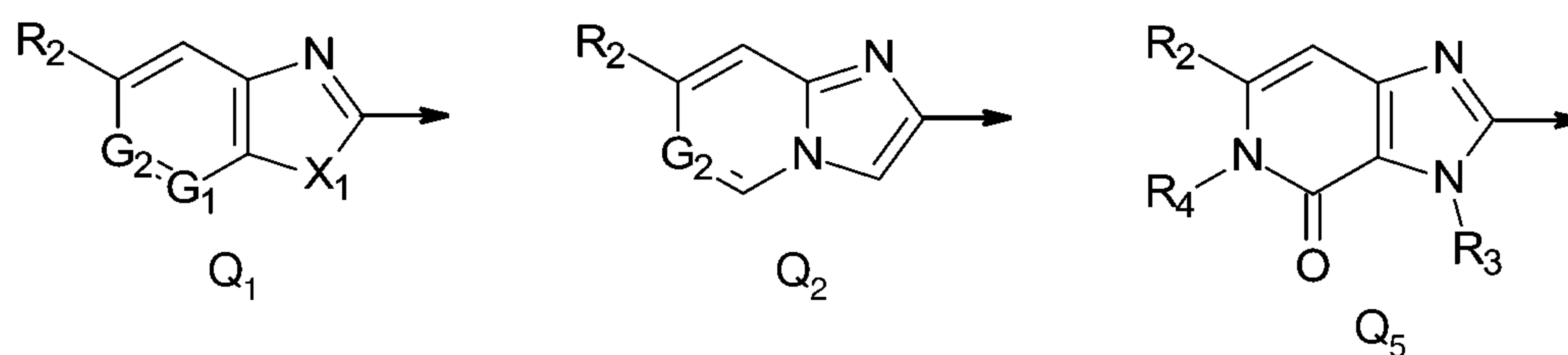
R_3 係甲基；

R_4 係甲基、乙基、2,2,2-三氟乙基、甲氧基或環丙基；並且

G_1 和 G_2 彼此獨立地是N或CH。

【0033】 實施方式11a提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

Q係選自 Q_1 、 Q_2 和 Q_5 的基團



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R_2 係三氟甲基、五氟乙基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；

X_1 係 NCH_3 ；

R_3 係甲基；

R_4 係乙基、甲氧基或環丙基；

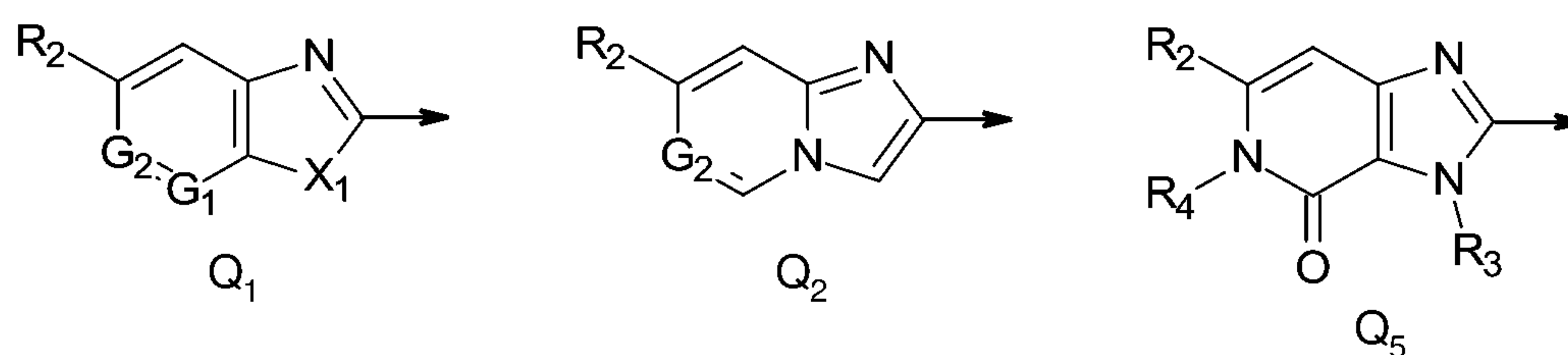
當 Q 係 Q_1 時， G_1 係N並且 G_2 係CH，或 G_1 係CH並且 G_2 係N，或 G_1 和 G_2 均是N；

並且

當 Q 係 Q_2 時， G_2 係CH或N。

【0034】 實施方式11b提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

Q 係選自 Q_1 、 Q_2 和 Q_5 的基團



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R_2 係三氟甲基、五氟乙基或三氟甲基氫硫基；

X_1 係 NCH_3 ；

R_3 係甲基；

R_4 係乙基或環丙基；

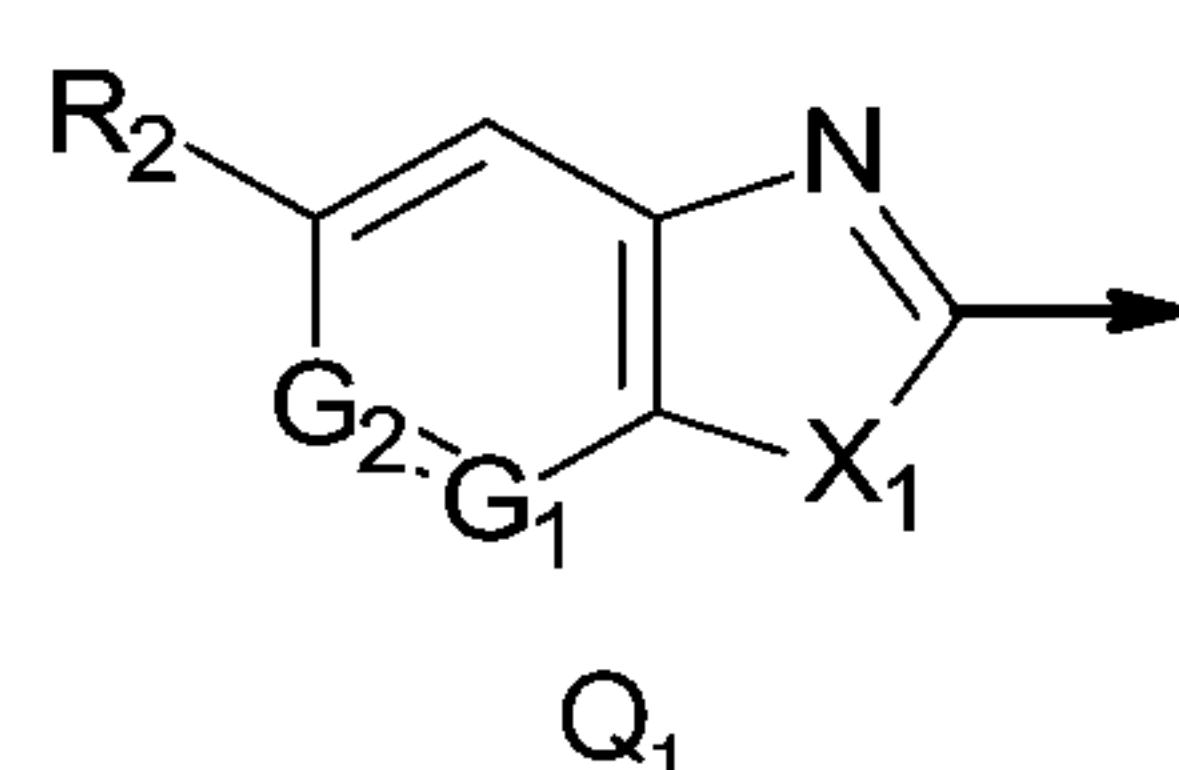
當 Q 係 Q_1 時， G_1 係N並且 G_2 係CH，或 G_1 係CH並且 G_2 係N，或 G_1 和 G_2 均是N；

並且

當 Q 係 Q_2 時， G_2 係CH或N。

【0035】 實施方式12提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

Q 係基團 Q_1



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R_2 係三氟甲基；

X_1 係 NCH_3 ；

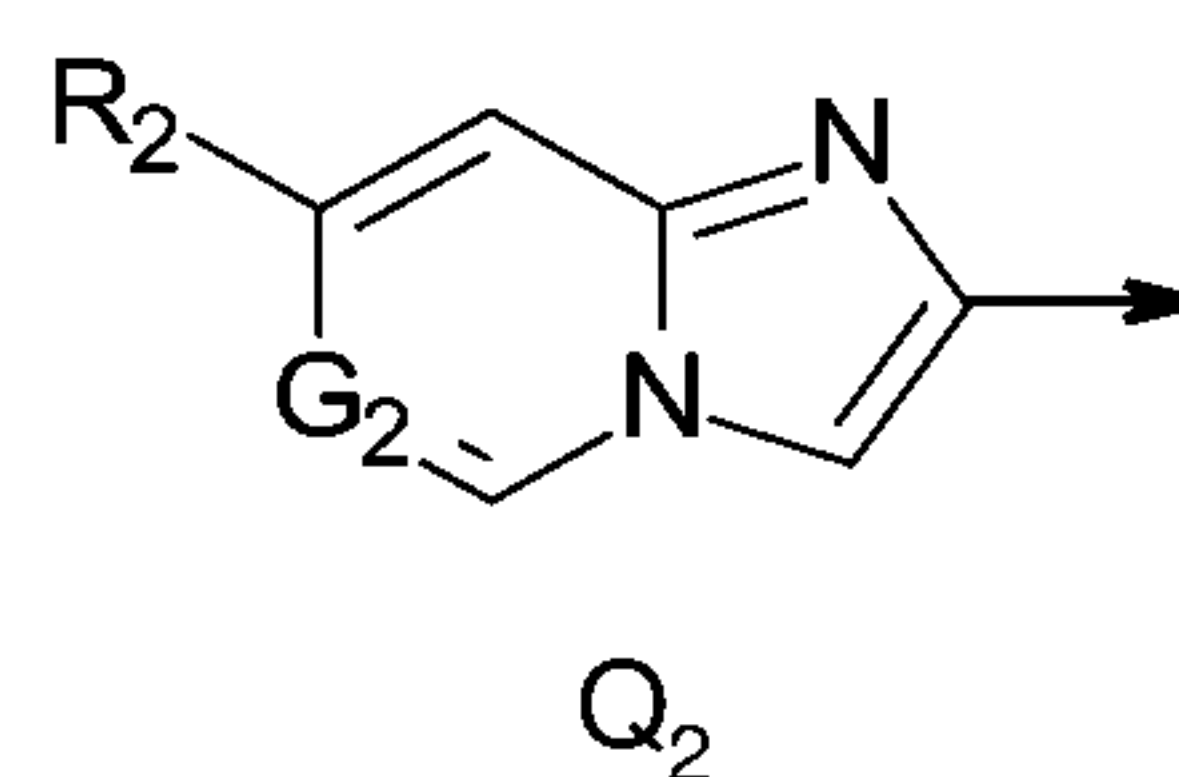
當 Q 係 Q_1 時， G_1 係N並且 G_2 係CH，或 G_1 係CH並且 G_2 係N，或 G_1 和 G_2 均是N；

並且

當 Q 係 Q_2 時， G_2 係CH或N。

【0036】 實施方式13a提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

Q 係基團 Q_2



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

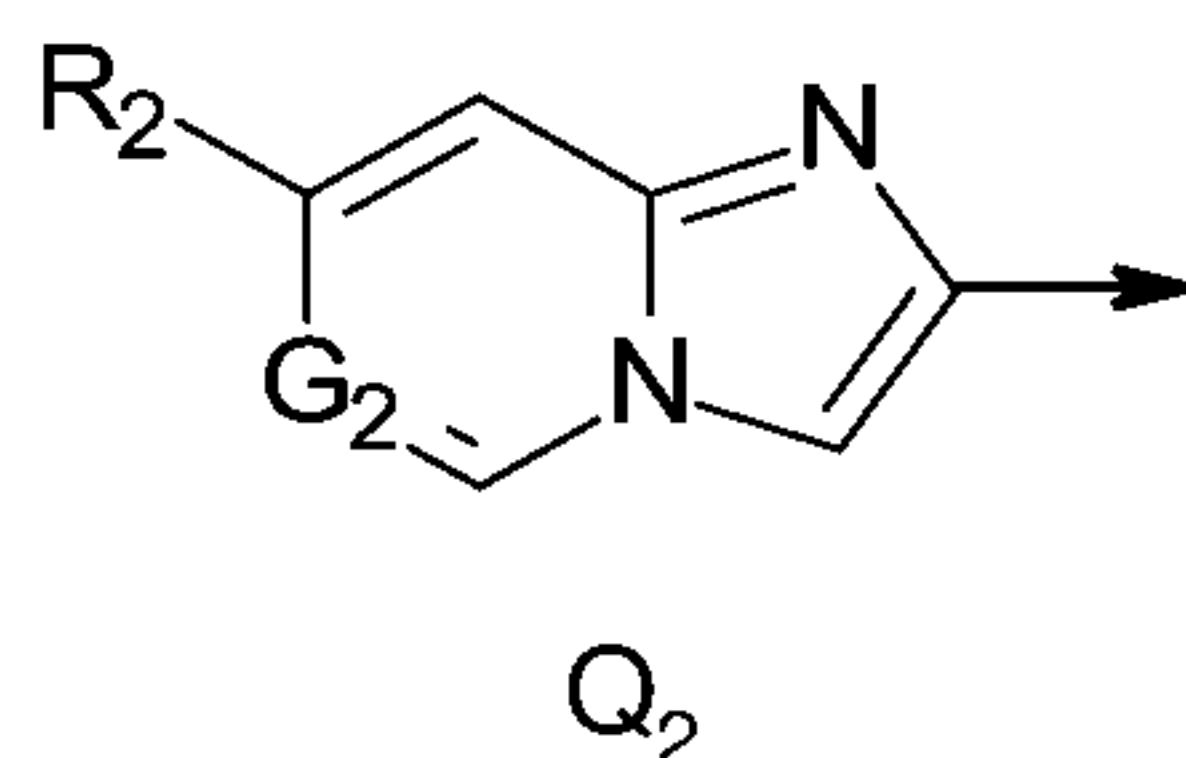
並且其中

R_2 係三氟甲基、五氟乙基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

G_2 係CH或N。

【0037】 實施方式13b提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

Q係基團 Q_2



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

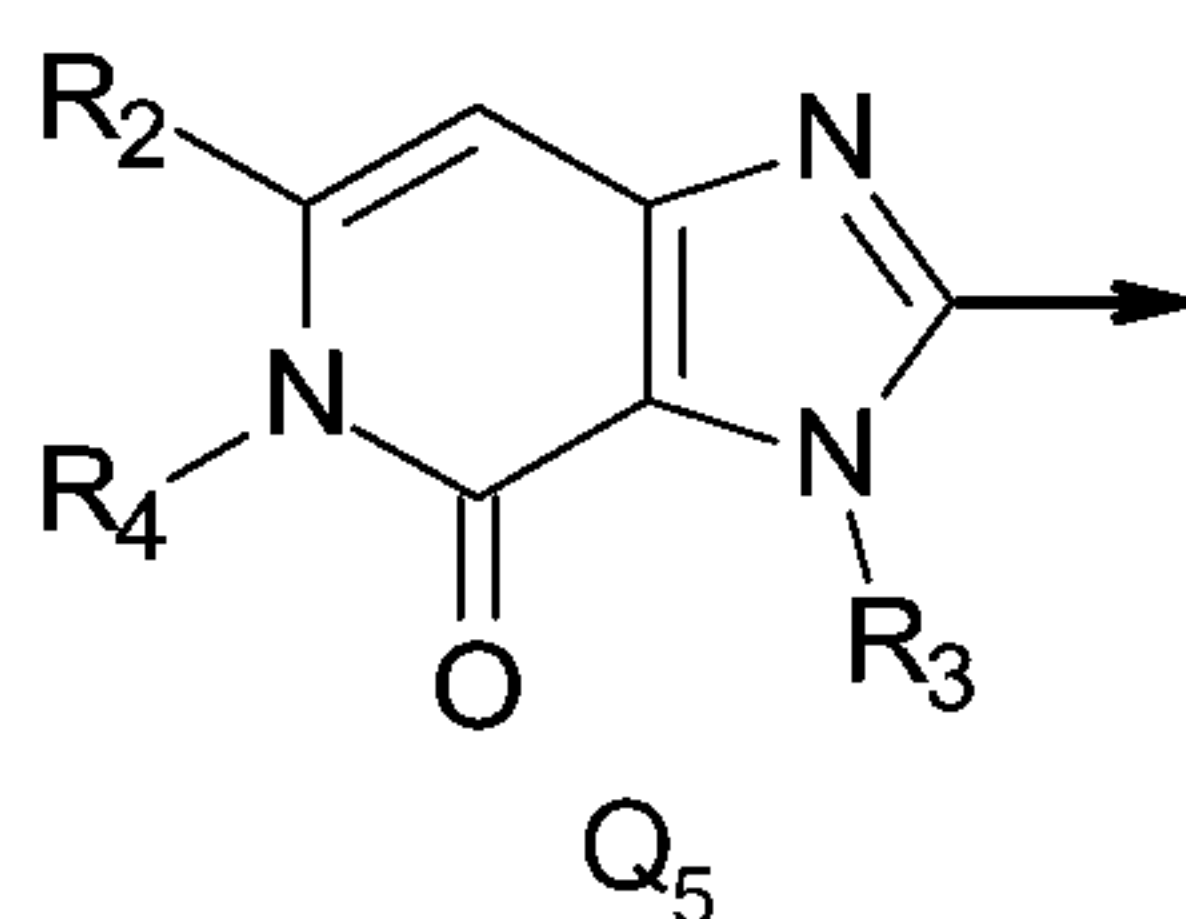
並且其中

R_2 係三氟甲基、五氟乙基或三氟甲基氫硫基；並且

G_2 係CH或N。

【0038】 實施方式14提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

Q係基團 Q_5



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R_2 係三氟甲基；

R_3 係甲基；並且

R_4 係乙基或環丙基。

【0039】 實施方式15提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接

受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係CH或N；

R₁係乙基、丙基或異丙基；

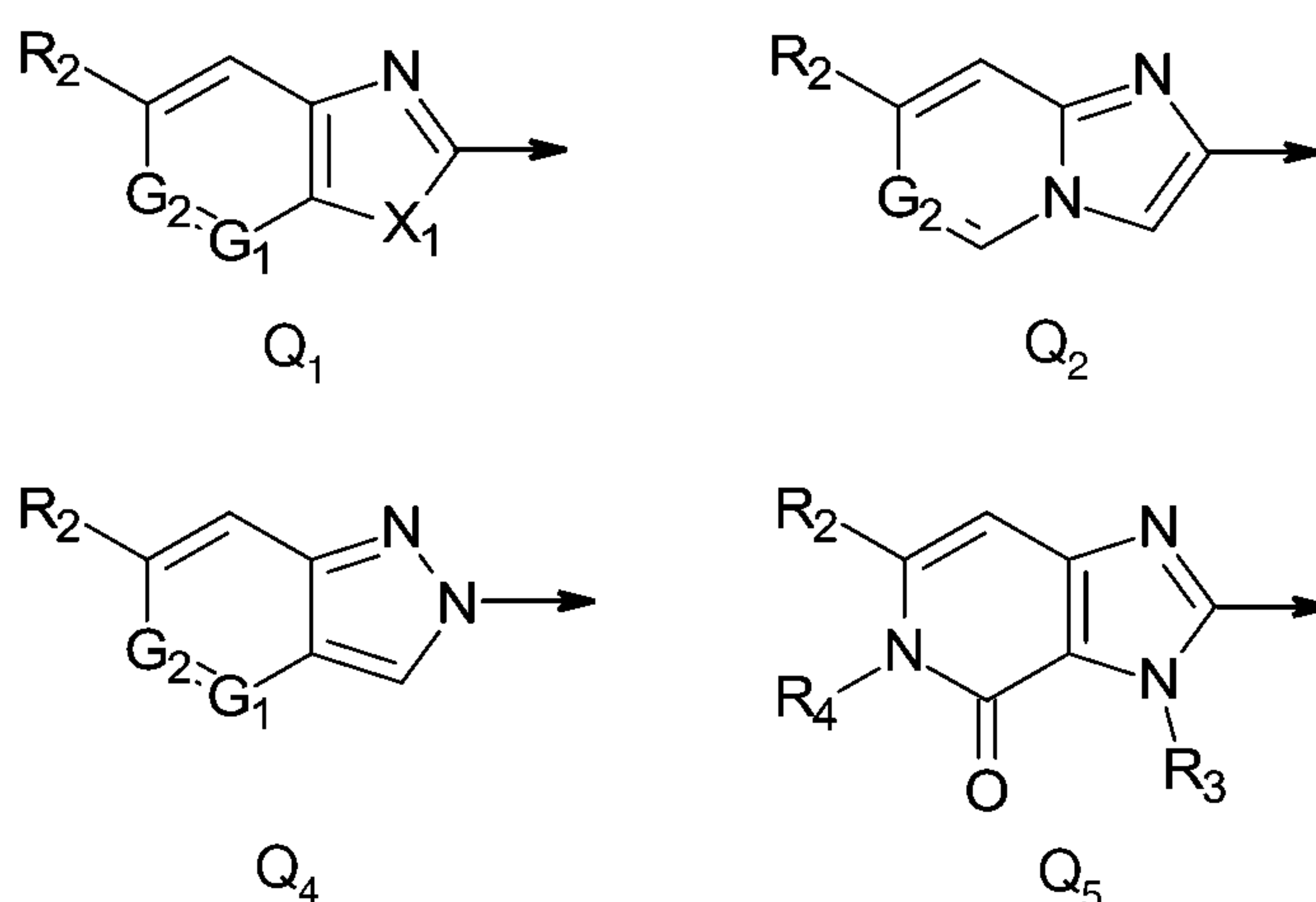
R₁₀係氫、氰基或-C(O)R₂₅，其中R₂₅係C₁-C₂鹵代烷基；

R₉係氫、甲基或乙基；

n係1；

R₇係氫或C₁-C₄烷基並且R₈係C₁-C₄烷基；

Q係選自Q₁、Q₂、Q₄和Q₅的基團



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R₂係C₁-C₂鹵代烷基、C₁-C₂鹵代烷基氫硫基、C₁-C₂鹵代烷基亞磺醯基或C₁-C₂鹵代烷基磺醯基；

X₁係氧或NCH₃；

R₃係C₁-C₂烷基；

R₄係C₁-C₂烷基、C₁-C₂鹵代烷基、C₁-C₂烷氧基或環丙基；並且

G₁和G₂彼此獨立地是N或CH。

【0040】 實施方式16提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係CH或N；

R₁係乙基；

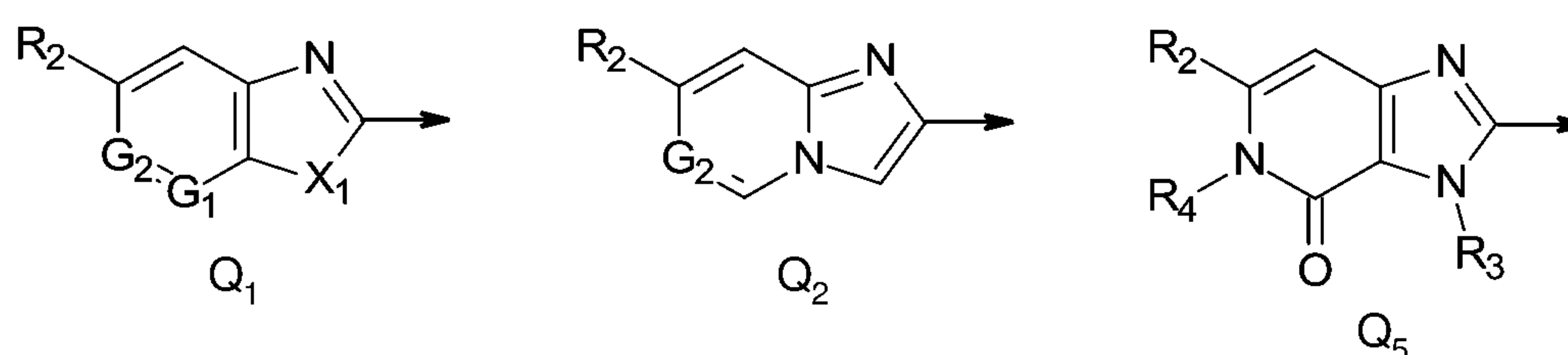
R₁₀係氫；

R₉係氫或甲基；

n係1；

R₇係氫、甲基或乙基並且R₈係甲基或乙基；

Q係選自Q₁、Q₂和Q₅的基團



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R₂係C₁-C₂氟烷基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、二氟甲基氫硫基、二氟甲基亞磺醯基、或二氟甲基磺醯基；

X₁係NCH₃；

R₃係甲基；

R₄係甲基、乙基、2,2,2-三氟乙基、甲氧基或環丙基；並且

G₁和G₂彼此獨立地是N或CH。

【0041】 實施方式17提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係CH或N；

R₁係乙基；

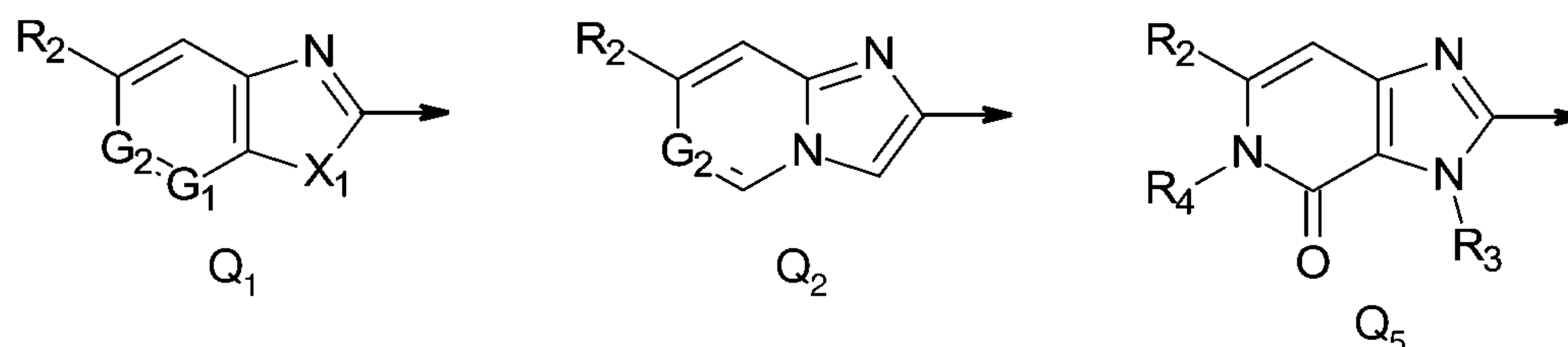
R₁₀係氫；

R₉係氫或甲基；

n係1；

R₇係甲基並且R₈係甲基；

Q係選自Q₁、Q₂和Q₅的基團



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R₂係C₁-C₂氟烷基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、二氟甲基氫硫基、二氟甲基亞磺醯基、或二氟甲基磺醯基；

X₁係NCH₃；

R₃係甲基；

R₄係甲基、乙基、2,2,2-三氟乙基、甲氧基或環丙基；並且

G₁和G₂彼此獨立地是N或CH。

【0042】 實施方式18提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係N；

R₁係乙基；

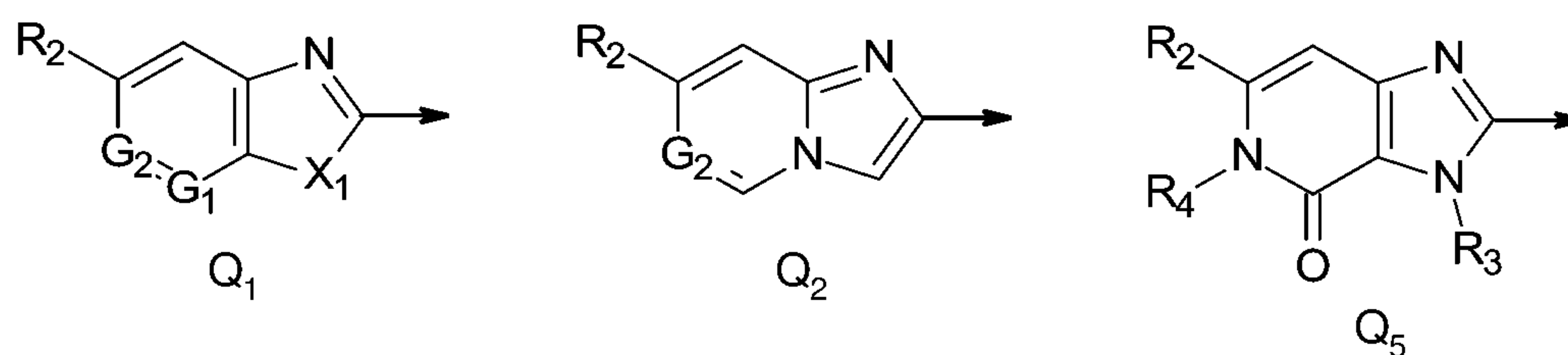
R₁₀係氫；

R₉係氫或甲基；

n係1；

R₇係甲基並且R₈係甲基；

Q係選自Q₁、Q₂和Q₅的基團



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R_2 係三氟甲基、五氟乙基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；

X_1 係 NCH_3 ；

R_3 係甲基；

R_4 係乙基、甲氧基或環丙基；

當Q係 Q_1 時， G_1 係N並且 G_2 係CH，或 G_1 係CH並且 G_2 係N，或 G_1 和 G_2 均是N；

並且

當Q係 Q_2 時， G_2 係CH或N。

【0043】 實施方式19提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係N；

R_1 係乙基；

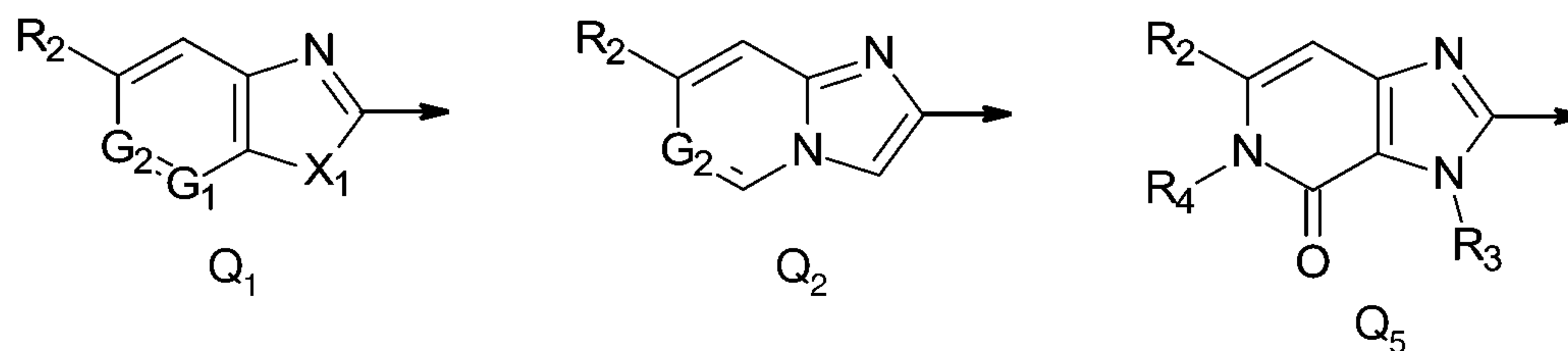
R_{10} 係氫；

R_9 係氫或甲基；

n係1；

R_7 係甲基並且 R_8 係甲基；

Q係選自 Q_1 、 Q_2 和 Q_5 的基團



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R_2 係三氟甲基、五氟乙基或三氟甲基氫硫基；

X_1 係 NCH_3 ；

R_3 係甲基；

R_4 係乙基或環丙基；

當Q係 Q_1 時， G_1 係N並且 G_2 係CH，或 G_1 係CH並且 G_2 係N，或 G_1 和 G_2 均是N；

並且

當Q係 Q_2 時， G_2 係CH或N。

【0044】 實施方式20提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係N；

R_1 係乙基；

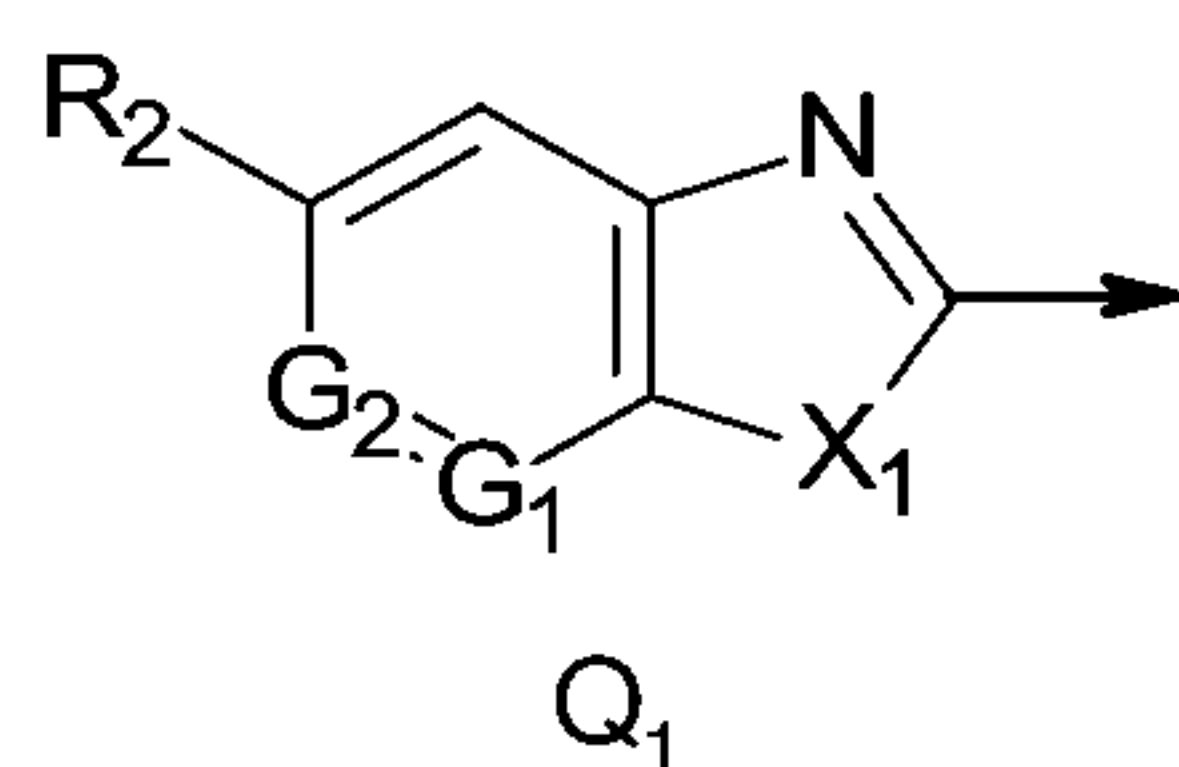
R_{10} 係氫；

R_9 係氫或甲基；

n係1；

R_7 係甲基並且 R_8 係甲基；

Q係基團 Q_1



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R_2 係三氟甲基；

X_1 係 NCH_3 ；並且

G_1 係N並且 G_2 係CH，或者 G_1 係CH並且 G_2 係N，或者 G_1 和 G_2 都是N。

【0045】 實施方式21提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係N；

R_1 係乙基；

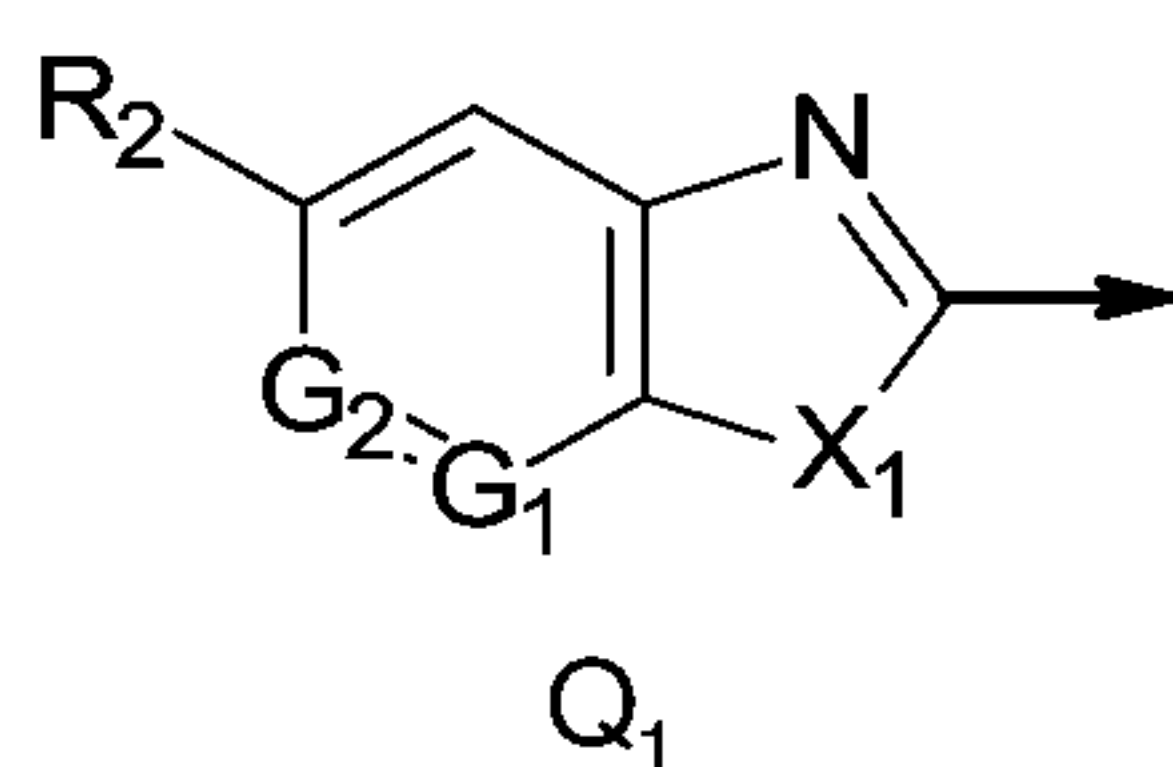
R_{10} 係氫；

R_9 係氫；

n係1；

R_7 係甲基並且 R_8 係甲基；

Q係基團 Q_1



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R_2 係三氟甲基；

X_1 係 NCH_3 ；並且

G_1 係N並且 G_2 係CH，或者 G_1 係CH並且 G_2 係N，或者 G_1 和 G_2 都是N。

【0046】 實施方式22提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係N；

R_1 係乙基；

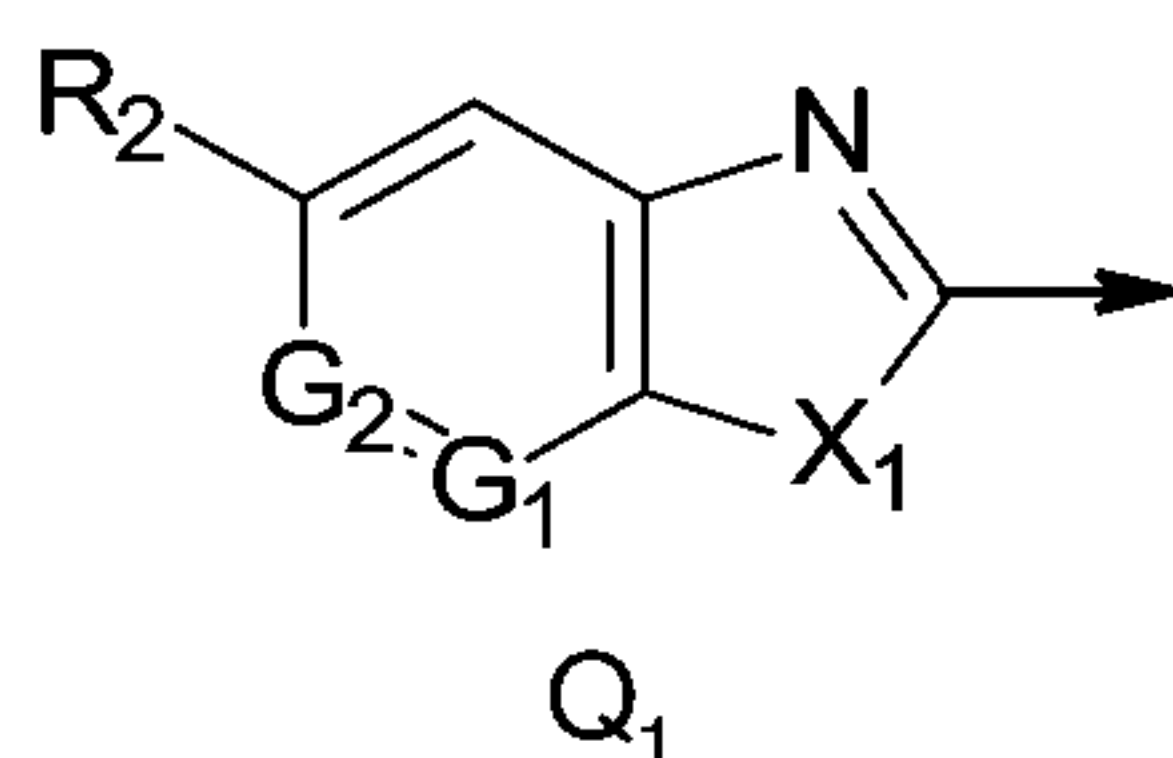
R_{10} 係氫；

R_9 係甲基；

n 係1；

R_7 係甲基並且 R_8 係甲基；

Q係基團 Q_1



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R_2 係三氟甲基；

X_1 係 NCH_3 ；並且

G_1 係N並且 G_2 係CH，或者 G_1 係CH並且 G_2 係N，或者 G_1 和 G_2 都是N。

【0047】 實施方式23提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係N；

R_1 係乙基；

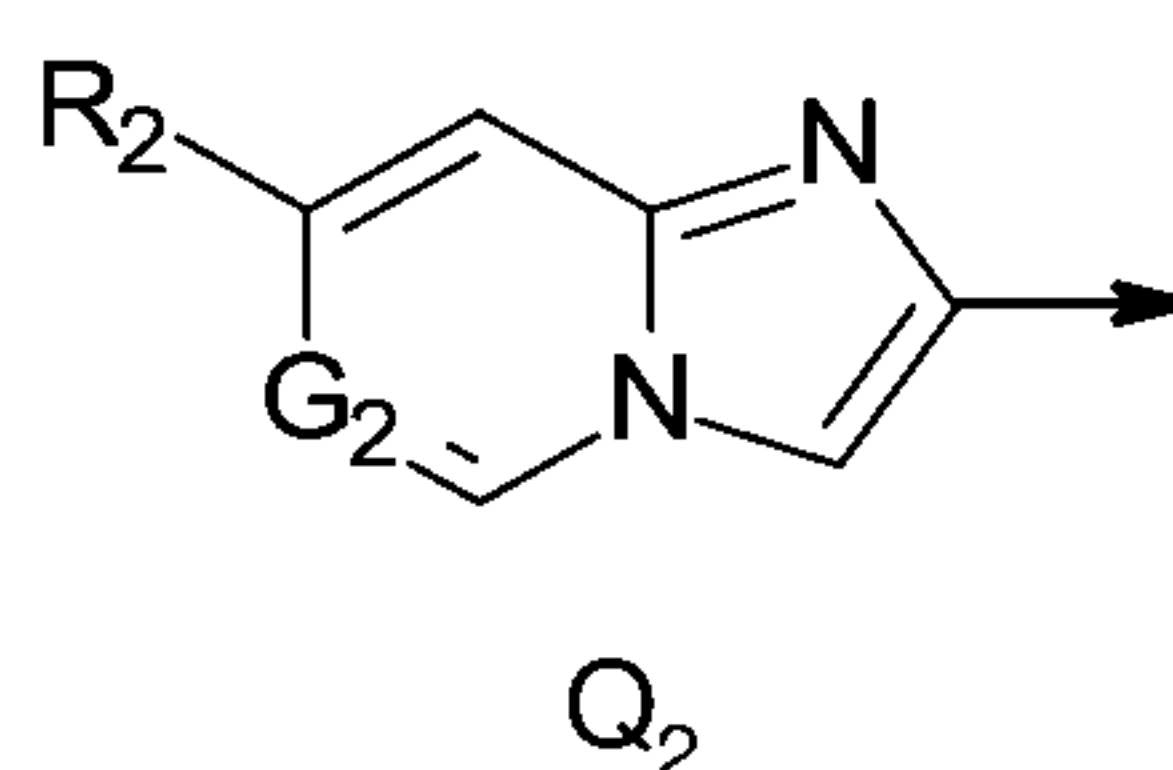
R_{10} 係氫；

R_9 係氫；

n 係1；

R_7 係甲基並且 R_8 係甲基；

Q係基團 Q_2



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R_2 係三氟甲基、五氟乙基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

G_2 係CH或N。

【0048】 實施方式24提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係N；

R_1 係乙基；

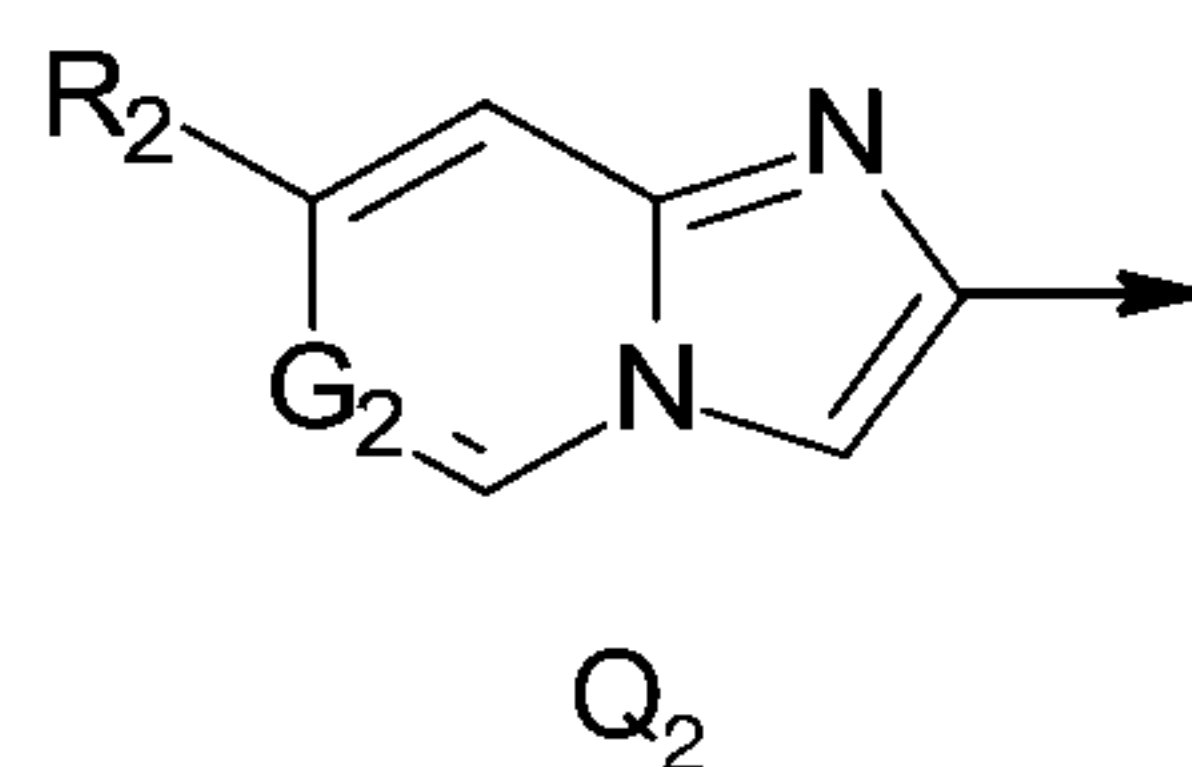
R_{10} 係氫；

R_9 係氫；

n係1；

R_7 係甲基並且 R_8 係甲基；

Q係基團 Q_2



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R_2 係三氟甲基、五氟乙基或三氟甲基氫硫基；並且

G_2 係CH或N。

【0049】 實施方式25提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係CH；

R_1 係乙基；

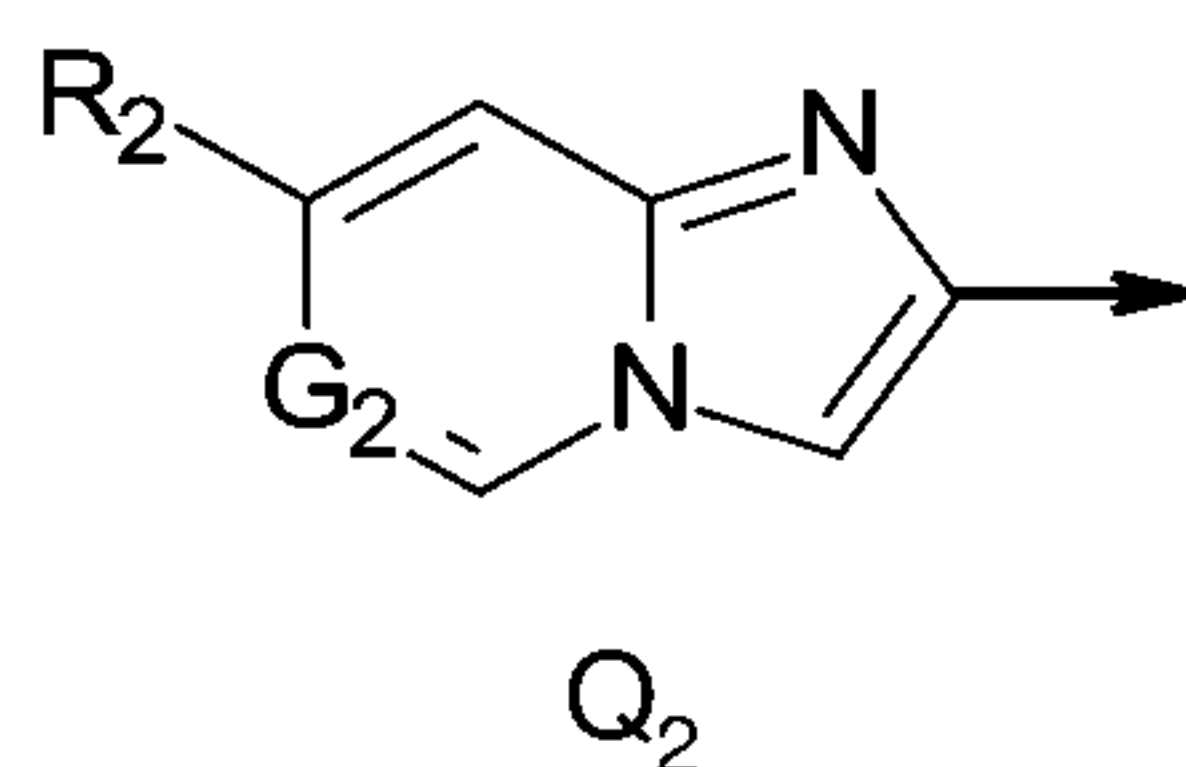
R_{10} 係氫；

R_9 係氫；

n 係1；

R_7 係甲基並且 R_8 係甲基；

Q係基團 Q_2



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R_2 係三氟甲基、五氟乙基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

G_2 係CH或N。

【0050】 實施方式26提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係CH；

R_1 係乙基；

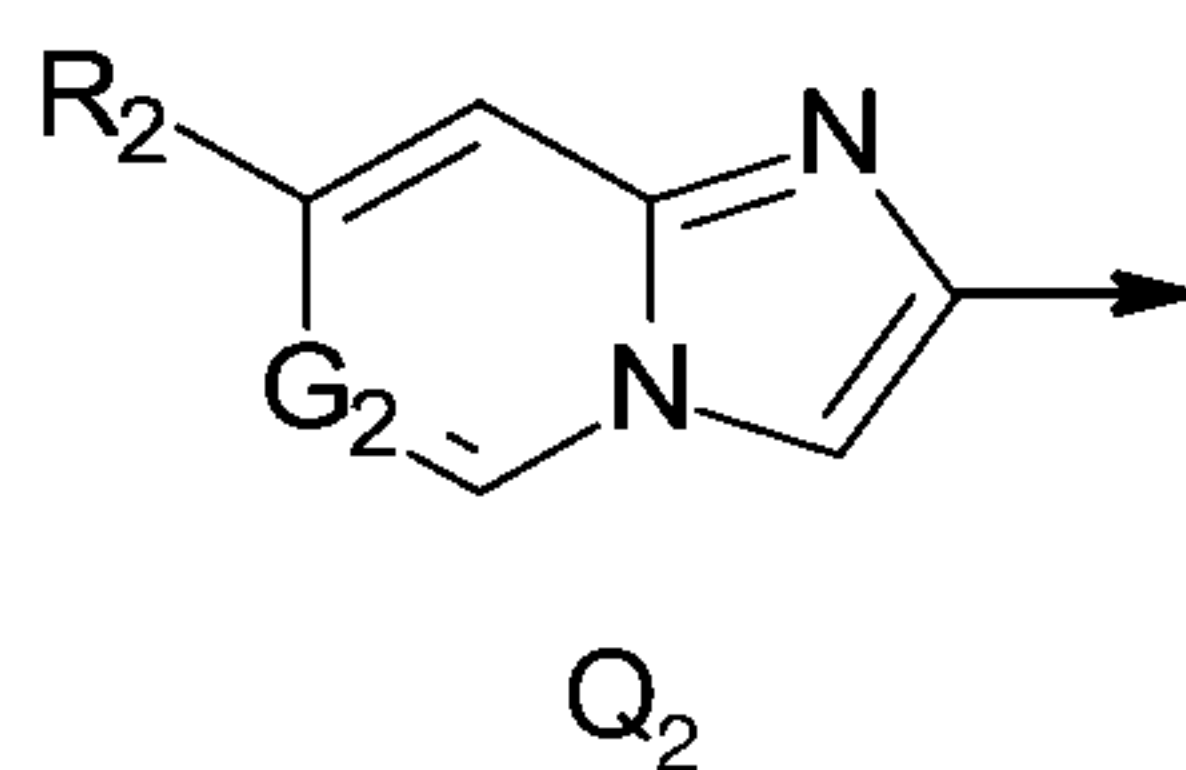
R_{10} 係氫；

R_9 係氫；

n 係1；

R_7 係甲基並且 R_8 係甲基；

Q係基團 Q_2



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R_2 係三氟甲基、五氟乙基或三氟甲基氫硫基；並且

G_2 係CH或N。

【0051】 實施方式27提供了根據實施方式1的化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，其中：

A係N；

R_1 係乙基；

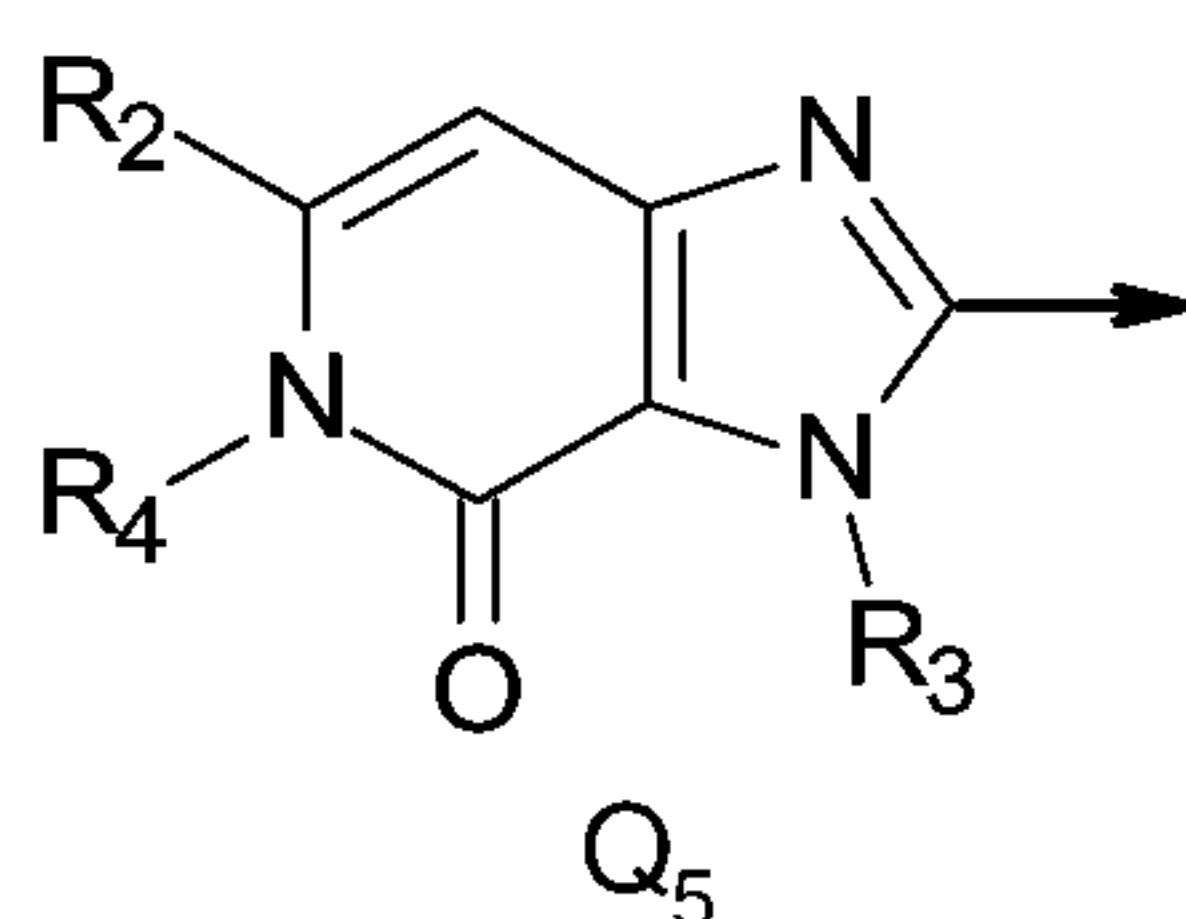
R_{10} 係氫；

R_9 係氫；

n係1；

R_7 係甲基並且 R_8 係甲基；

Q係基團 Q_5



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R_2 係三氟甲基；

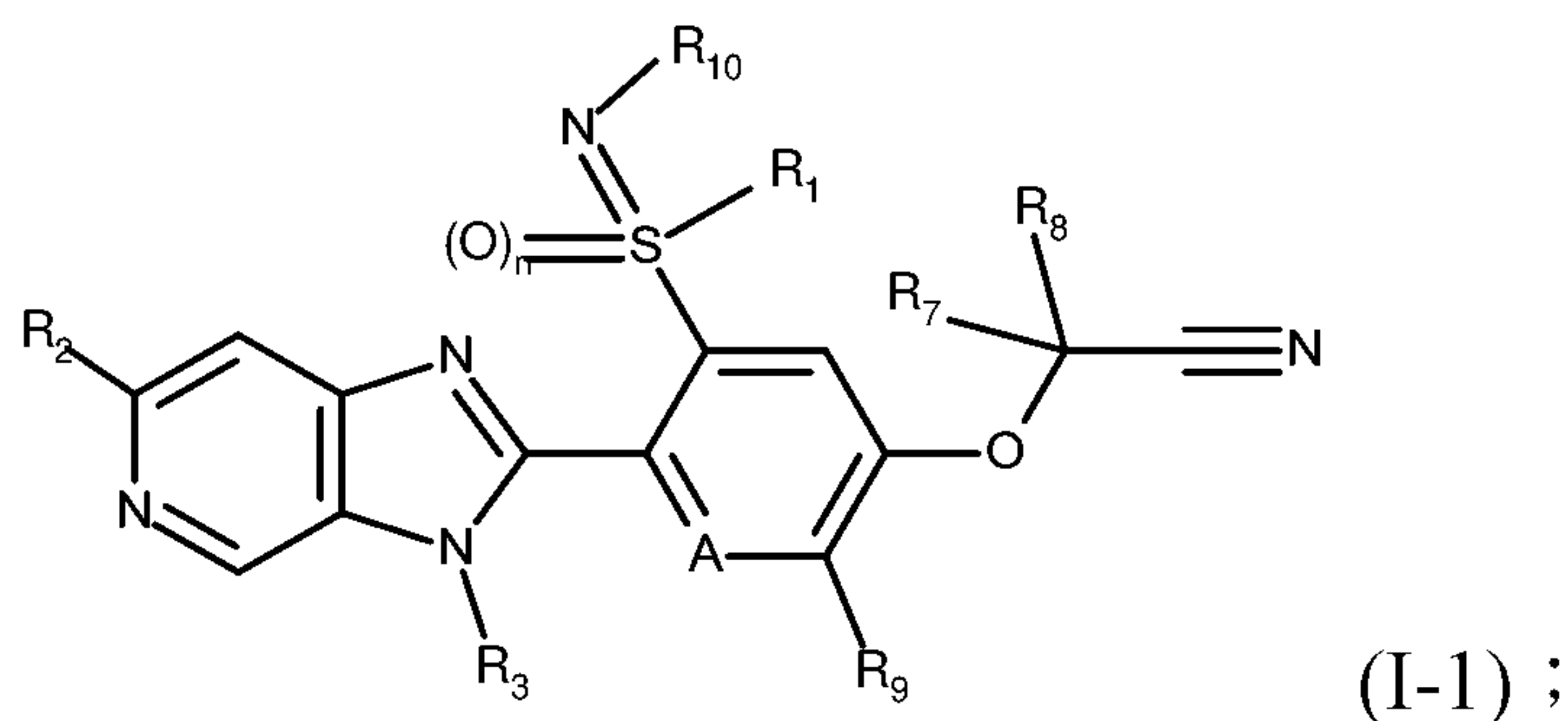
R_3 係甲基；並且

R_4 係乙基或環丙基。

【0052】 實施方式28提供了根據實施方式1、2、3a、3b、4a、4b、6、7、8a、8b、8c、9、10、11a、11b、13a、13b、14、15、16、17、18、19、23或24中任一項的化合物，或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、

互變異構物或N-氧化物，條件係：排除2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-(1,1,2,2,2-五氟乙基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈；和2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈。

【0053】 式I的化合物的較佳的群組由式I-1的化合物表示



其中 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、A和n係如上式I所定義的。

【0054】 在較佳的一組式I-1的化合物中，A係CH或N； R_1 係乙基、丙基或異丙基； R_2 係 C_1 - C_2 鹵代烷基、 C_1 - C_2 鹵代烷基氫硫基、 C_1 - C_2 鹵代烷基亞磺醯基或 C_1 - C_2 鹵代烷基磺醯基； R_3 係 C_1 - C_2 烷基； R_9 係氫、甲基或乙基； R_{10} 係氫、氰基或 $-C(O)R_{25}$ ，其中 R_{25} 係 C_1 - C_2 鹵代烷基並且n係1。

【0055】 在較佳的另一組式I-1的化合物中，A係CH或N； R_1 係乙基； R_2 係 C_1 - C_2 氟烷基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、二氟甲基氫硫基、二氟甲基亞磺醯基、或二氟甲基磺醯基； R_3 係甲基； R_9 係氫或甲基，較佳的是 R_9 係氫； R_{10} 係氫；並且n係1。

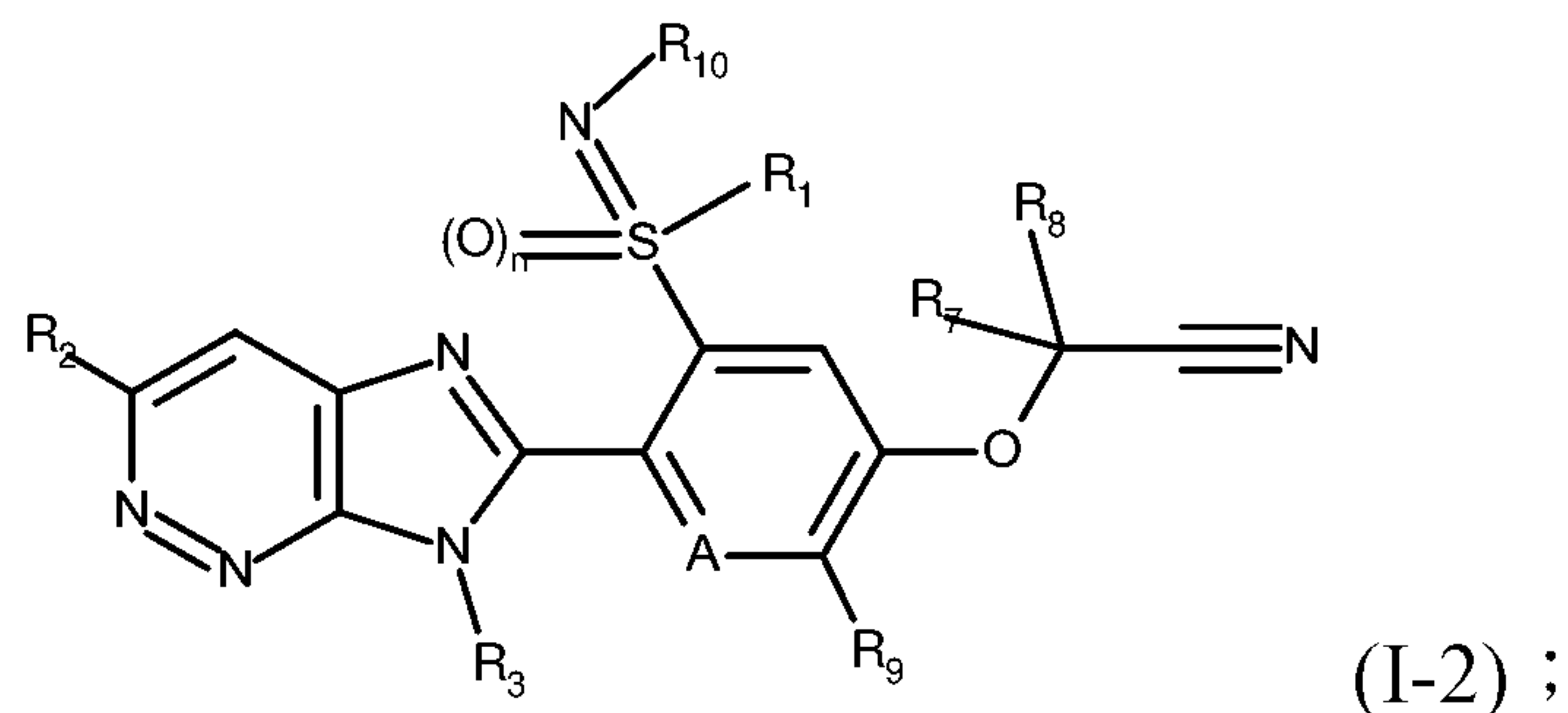
【0056】 在較佳的另外一組式I-1的化合物中， R_7 係氫或 C_1 - C_4 烷基；並且 R_8 係 C_1 - C_4 烷基。

【0057】 在較佳的另一組式I-1的化合物中， R_7 係氫、甲基或乙基；並且 R_8 係甲基或乙基；較佳的是 R_7 係甲基；並且 R_8 係甲基。

【0058】 在式I-1的化合物和上述式I-1的化合物的所有較佳的實施方式中，除非另有說明，否則 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、A和n係如上式I所定義的；A係CH或N，較佳的是A係N； R_2 係三氟甲基、五氟乙基或三氟甲基氫硫基；

較佳的是 R_2 係三氟甲基； R_3 係甲基； R_7 係甲基或乙基，較佳的是 R_7 係甲基； R_8 係甲基或乙基，較佳的是 R_8 係甲基； R_9 係氫； R_{10} 係氫；並且 n 係1。

【0059】 較佳的另一組式I的化合物由式I-2的化合物表示



其中 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 A 和 n 係如上式I所定義的。

【0060】 在較佳的一組式I-2的化合物中， A 係CH或N； R_1 係乙基、丙基或異丙基； R_2 係 C_1 - C_2 鹵代烷基、 C_1 - C_2 鹵代烷基氫硫基、 C_1 - C_2 鹵代烷基亞磺醯基或 C_1 - C_2 鹵代烷基磺醯基； R_3 係 C_1 - C_2 烷基； R_9 係氫、甲基或乙基； R_{10} 係氫、氰基或 $-C(O)R_{25}$ ，其中 R_{25} 係 C_1 - C_2 鹵代烷基並且 n 係1。

【0061】 在較佳的另一組式I-2的化合物中， A 係CH或N； R_1 係乙基； R_2 係 C_1 - C_2 氟烷基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、二氟甲基氫硫基、二氟甲基亞磺醯基、或二氟甲基磺醯基； R_3 係甲基； R_9 係氫或甲基，較佳的是 R_9 係氫； R_{10} 係氫；並且 n 係1。

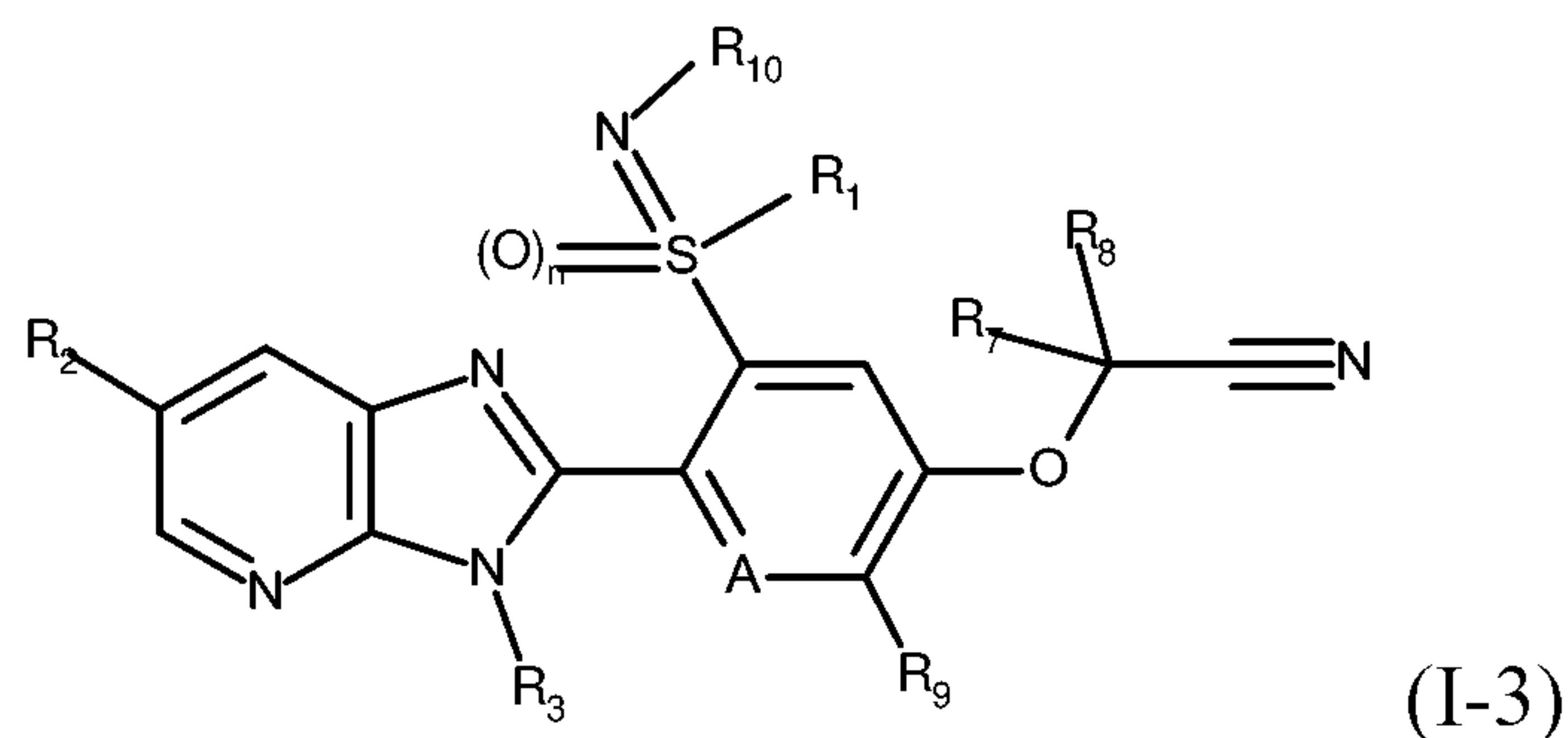
【0062】 在較佳的另外一組式I-2的化合物中， R_7 係氫或 C_1 - C_4 烷基；並且 R_8 係 C_1 - C_4 烷基。

【0063】 在較佳的另一組式I-2的化合物中， R_7 係氫、甲基或乙基；並且 R_8 係甲基或乙基；較佳的是 R_7 係甲基；並且 R_8 係甲基。

【0064】 在式I-2的化合物和上述式I-2的化合物的所有較佳的實施方式中，除非另有說明，否則 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 A 和 n 係如上式I所定義的；較佳的是 A 係CH或N，更較佳的是 A 係N； R_2 係三氟甲基、五氟乙基或三氟甲基氫硫基；較佳的是 R_2 係三氟甲基； R_3 係甲基； R_7 係甲基或乙基，較佳的是 R_7

係甲基； R_8 係甲基或乙基，較佳的是 R_8 係甲基； R_9 係氫； R_{10} 係氫；並且 n 係1。

【0065】 較佳的另一組式I的化合物由式I-3的化合物表示



其中 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、A和 n 係如上式I所定義的。

【0066】 在較佳的一組式I-3的化合物中，A係CH或N； R_1 係乙基、丙基或異丙基； R_2 係 C_1 - C_2 鹵代烷基、 C_1 - C_2 鹵代烷基氫硫基、 C_1 - C_2 鹵代烷基亞磺醯基或 C_1 - C_2 鹵代烷基磺醯基； R_3 係 C_1 - C_2 烷基； R_9 係氫、甲基或乙基； R_{10} 係氫、氰基或 $-C(O)R_{25}$ ，其中 R_{25} 係 C_1 - C_2 鹵代烷基並且 n 係1。

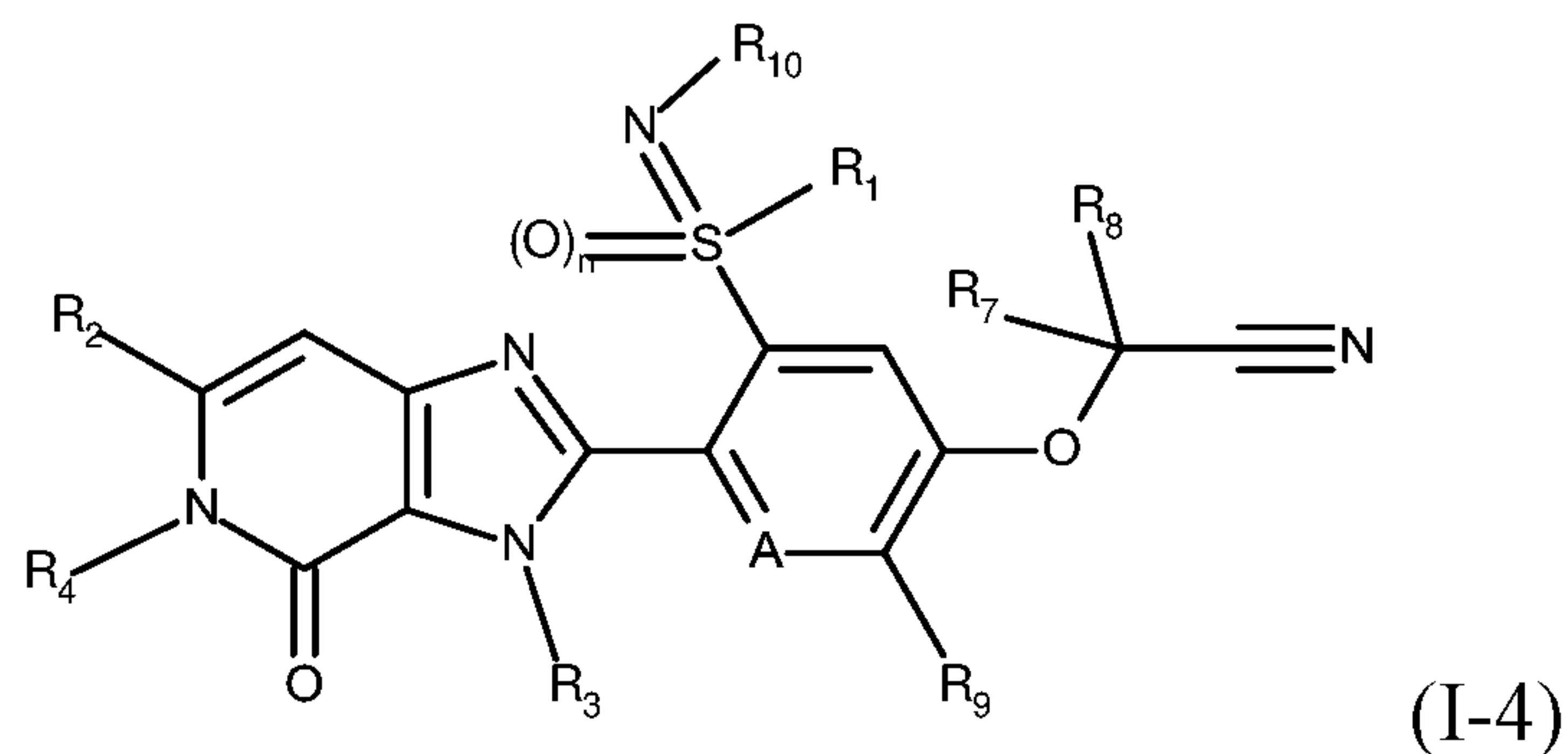
【0067】 在較佳的另一組式I-3的化合物中，A係CH或N； R_1 係乙基； R_2 係 C_1 - C_2 氟烷基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、二氟甲基氫硫基、二氟甲基亞磺醯基、或二氟甲基磺醯基； R_3 係甲基； R_9 係氫或甲基，較佳的是 R_9 係氫； R_{10} 係氫；並且 n 係1。

【0068】 在較佳的另外一組式I-3的化合物中， R_7 係氫或 C_1 - C_4 烷基；並且 R_8 係 C_1 - C_4 烷基。

【0069】 在較佳的另一組式I-3的化合物中， R_7 係氫、甲基或乙基；並且 R_8 係甲基或乙基；較佳的是 R_7 係甲基；並且 R_8 係甲基。

【0070】 在式I-3的化合物和上述式I-3的化合物的所有較佳的實施方式中，除非另有說明，否則 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、A和 n 係如上式I所定義的；較佳的是A係CH或N，更較佳的是A係N； R_2 係三氟甲基、五氟乙基或三氟甲基氫硫基；較佳的是 R_2 係三氟甲基； R_3 係甲基； R_7 係甲基或乙基，較佳的是 R_7 係甲基； R_8 係甲基或乙基，較佳的是 R_8 係甲基； R_9 係氫； R_{10} 係氫；並且 n 係1。

【0071】 較佳的另一組式I的化合物由式I-4的化合物表示



其中 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、A和n係如上式I所定義的。

【0072】 在較佳的一組式I-4的化合物中，A係CH或N； R_1 係乙基、丙基或異丙基； R_2 係 C_1 - C_2 鹵代烷基、 C_1 - C_2 鹵代烷基氫硫基、 C_1 - C_2 鹵代烷基亞磺醯基或 C_1 - C_2 鹵代烷基磺醯基； R_3 係 C_1 - C_2 烷基； R_4 係 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵代烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或環丙基； R_9 係氫、甲基或乙基； R_{10} 係氫、氰基或 $-C(O)R_{25}$ ，其中 R_{25} 係 C_1 - C_2 鹵代烷基並且n係1。

【0073】 在較佳的另一組式I-4的化合物中，A係CH或N； R_1 係乙基； R_2 係 C_1 - C_2 氟烷基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、二氟甲基氫硫基、二氟甲基亞磺醯基、或二氟甲基磺醯基； R_3 係甲基； R_4 係甲基、乙基、甲氧基或環丙基； R_9 係氫或甲基，較佳的是 R_9 係氫； R_{10} 係氫；並且n係1。

【0074】 在較佳的另一組式I-4的化合物中， R_4 係乙基或環丙基。

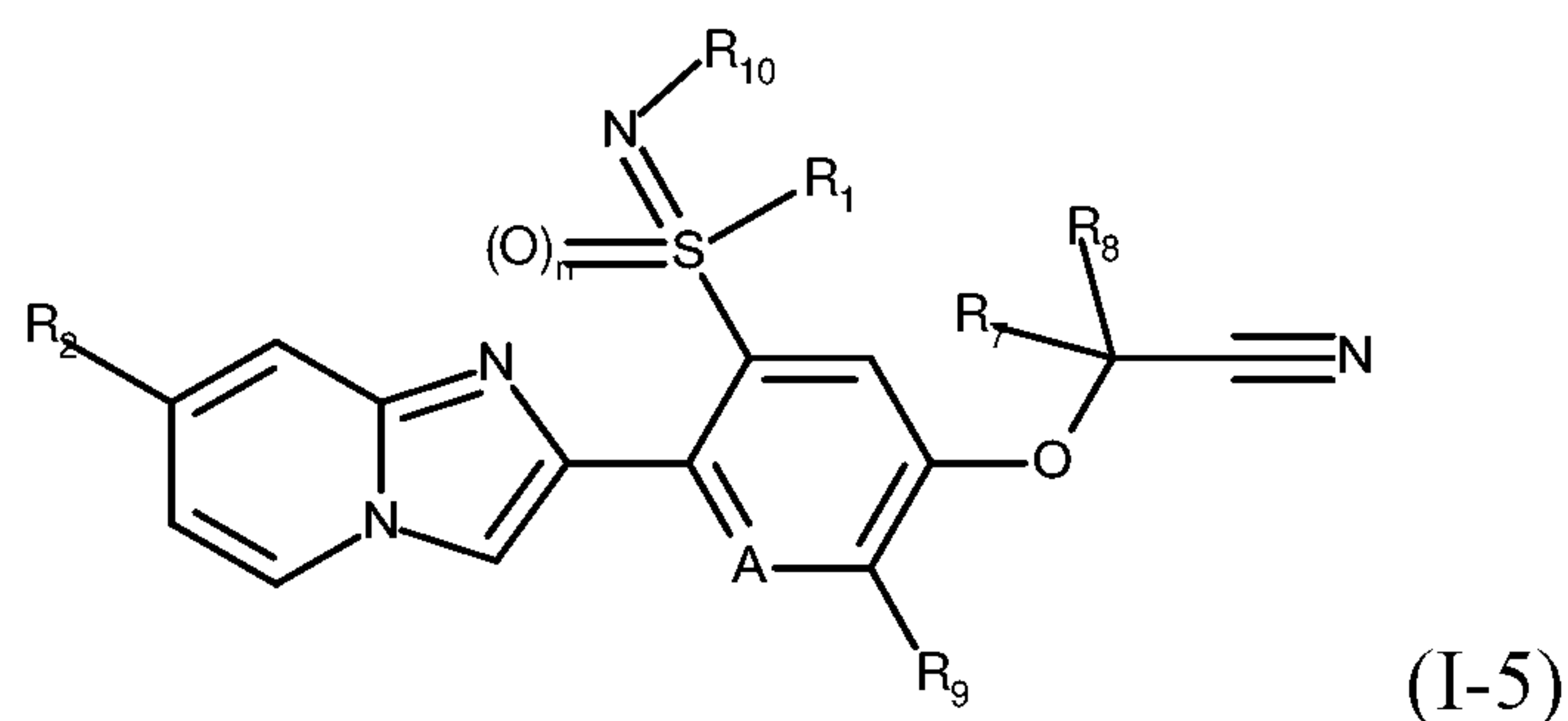
【0075】 在較佳的另外一組式I-4的化合物中， R_7 係氫或 C_1 - C_4 烷基；並且 R_8 係 C_1 - C_4 烷基。

【0076】 在較佳的另一組式I-4的化合物中， R_7 係氫、甲基或乙基；並且 R_8 係甲基或乙基；較佳的是 R_7 係甲基；並且 R_8 係甲基。

【0077】 在式I-4的化合物和上述式I-4的化合物的所有較佳的實施方式中，除非另有說明，否則 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、A和n係如上式I所定義的；較佳的是A係CH或N，更較佳的是A係N； R_2 係三氟甲基、五氟乙基或三氟甲基氫硫基；較佳的是 R_2 係三氟甲基； R_3 係甲基； R_4 係乙基或環丙基； R_7

係甲基或乙基，較佳的是R₇係甲基；R₈係甲基或乙基，較佳的是R₈係甲基；R₉係氫；R₁₀係氫；並且n係1。

【0078】 較佳的另一組式I的化合物由式I-5的化合物表示



其中R₁、R₂、R₇、R₈、R₉、R₁₀、A和n係如上式I所定義的。

【0079】 在較佳的一組式I-5的化合物中，A係CH或N；R₁係乙基、丙基或異丙基；R₂係C₁-C₂鹵代烷基、C₁-C₂鹵代烷基氫硫基、C₁-C₂鹵代烷基亞磺醯基或C₁-C₂鹵代烷基磺醯基；R₉係氫、甲基或乙基；R₁₀係氫、氰基或-C(O)R₂₅，其中R₂₅係C₁-C₂鹵代烷基並且n係1。

【0080】 在較佳的另一組式I-5的化合物中，A係CH或N；R₁係乙基；R₂係C₁-C₂氟烷基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、二氟甲基氫硫基、二氟甲基亞磺醯基、或二氟甲基磺醯基；R₉係氫或甲基，較佳的是R₉係氫；R₁₀係氫；並且n係1。

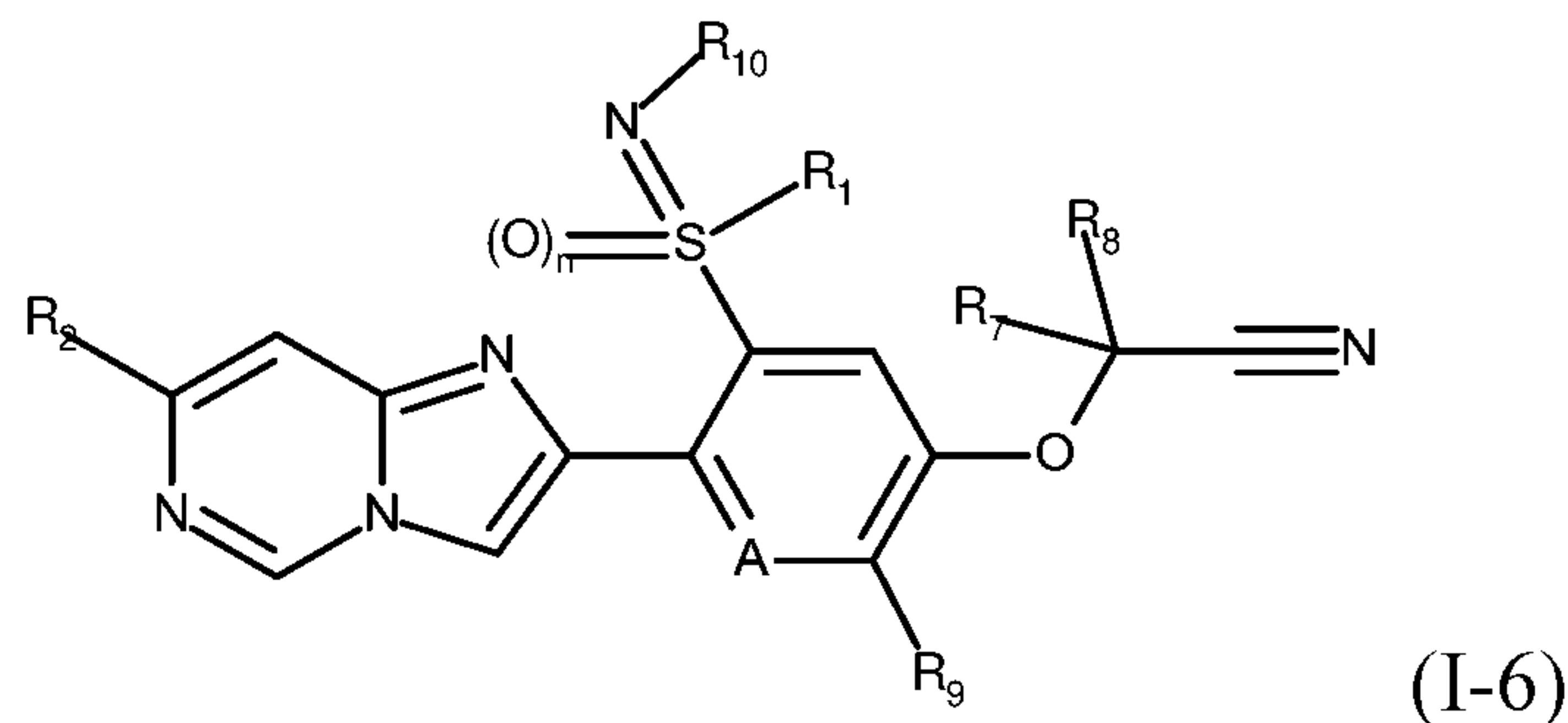
【0081】 在較佳的另外一組式I-5的化合物中，R₇係氫或C₁-C₄烷基；並且R₈係C₁-C₄烷基。

【0082】 在較佳的另一組式I-5的化合物中，R₇係氫、甲基或乙基；並且R₈係甲基或乙基；較佳的是R₇係甲基；並且R₈係甲基。

【0083】 在式I-5的化合物和上述式I-5的化合物的所有較佳的實施方式中，除非另有說明，否則R₁、R₂、R₇、R₈、R₉、R₁₀、A和n係如上式I所定義的；較佳的是A係CH或N，更較佳的是A係N；R₂係三氟甲基、五氟乙基或三氟甲基氫硫基；較佳的是R₂係三氟甲基；R₇係甲基或乙基，較佳的是R₇係甲基；R₈係

甲基或乙基，較佳的是R₈係甲基；R₉係氫；R₁₀係氫；並且n係1。

【0084】 較佳的另一組式I的化合物由式I-6的化合物表示



其中R₁、R₂、R₇、R₈、R₉、R₁₀、A和n係如上式I所定義的。

【0085】 在較佳的一組式I-6的化合物中，A係CH或N；R₁係乙基、丙基或異丙基；R₂係C₁-C₂鹵代烷基、C₁-C₂鹵代烷基氫硫基、C₁-C₂鹵代烷基亞磺醯基或C₁-C₂鹵代烷基磺醯基；R₉係氫、甲基或乙基；R₁₀係氫、氰基或-C(O)R₂₅，其中R₂₅係C₁-C₂鹵代烷基並且n係1。

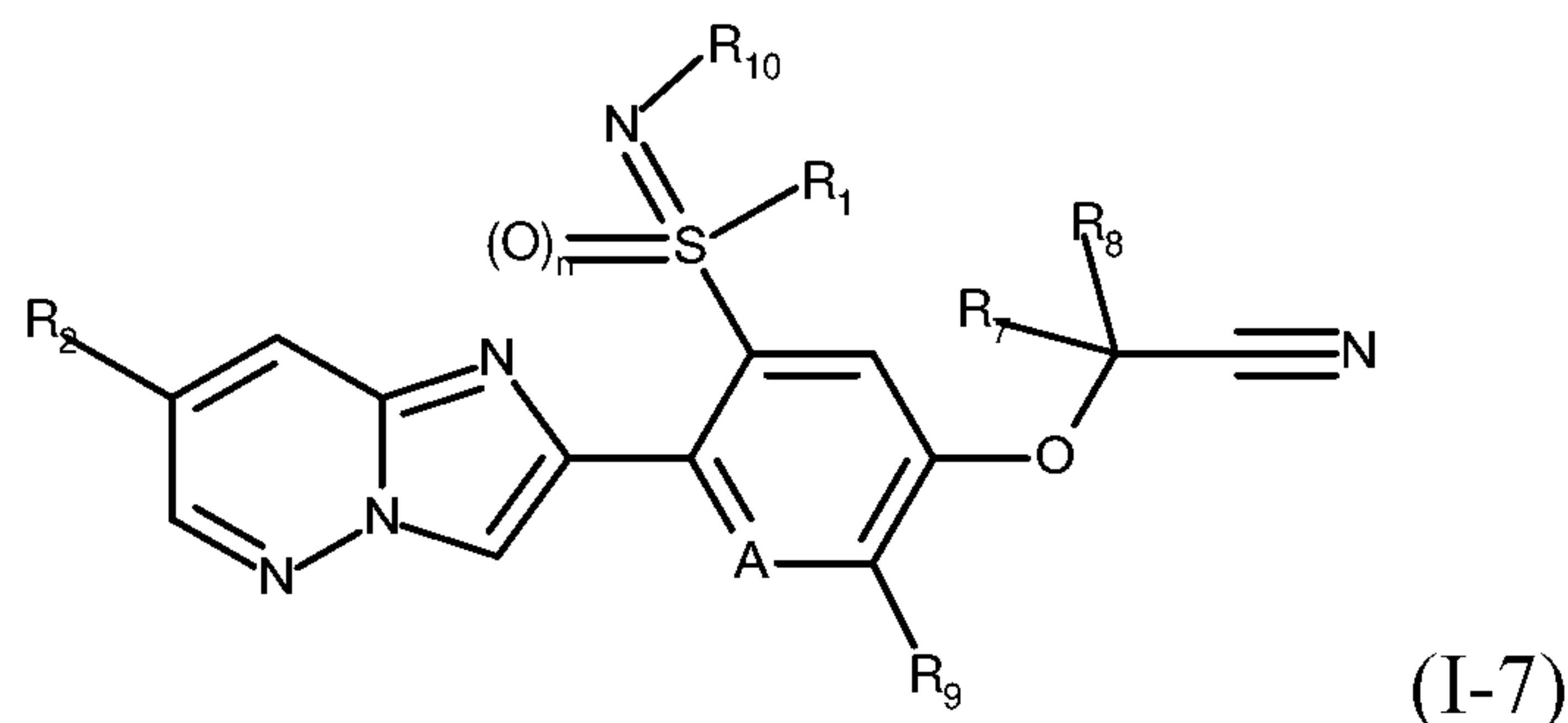
【0086】 在較佳的另一組式I-6的化合物中，A係CH或N；R₁係乙基；R₂係C₁-C₂氟烷基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、二氟甲基氫硫基、二氟甲基亞磺醯基、或二氟甲基磺醯基；R₉係氫或甲基，較佳的是R₉係氫；R₁₀係氫；並且n係1。

【0087】 在較佳的另外一組式I-6的化合物中，R₇係氫或C₁-C₄烷基；並且R₈係C₁-C₄烷基。

【0088】 在較佳的另一組式I-6的化合物中，R₇係氫、甲基或乙基；並且R₈係甲基或乙基；較佳的是R₇係甲基；並且R₈係甲基。

【0089】 在式I-6的化合物和上述式I-6的化合物的所有較佳的實施方式中，除非另有說明，否則R₁、R₂、R₇、R₈、R₉、R₁₀、A和n係如上式I所定義的；較佳的是A係CH或N，更較佳的是A係N；R₂係三氟甲基、五氟乙基或三氟甲基氫硫基；較佳的是R₂係三氟甲基；R₇係甲基或乙基，較佳的是R₇係甲基；R₈係甲基或乙基，較佳的是R₈係甲基；R₉係氫；R₁₀係氫；並且n係1。

【0090】 較佳的另一組式I的化合物由式I-7的化合物表示



其中 R_1 、 R_2 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、A和n係如上式I所定義的。

【0091】 在較佳的一組式I-7的化合物中，A係CH或N； R_1 係乙基、丙基或異丙基； R_2 係 C_1 - C_2 鹵代烷基、 C_1 - C_2 鹵代烷基氫硫基、 C_1 - C_2 鹵代烷基亞磺醯基或 C_1 - C_2 鹵代烷基磺醯基； R_9 係氫、甲基或乙基； R_{10} 係氫、氰基或 $-C(O)R_{25}$ ，其中 R_{25} 係 C_1 - C_2 鹵代烷基並且n係1。

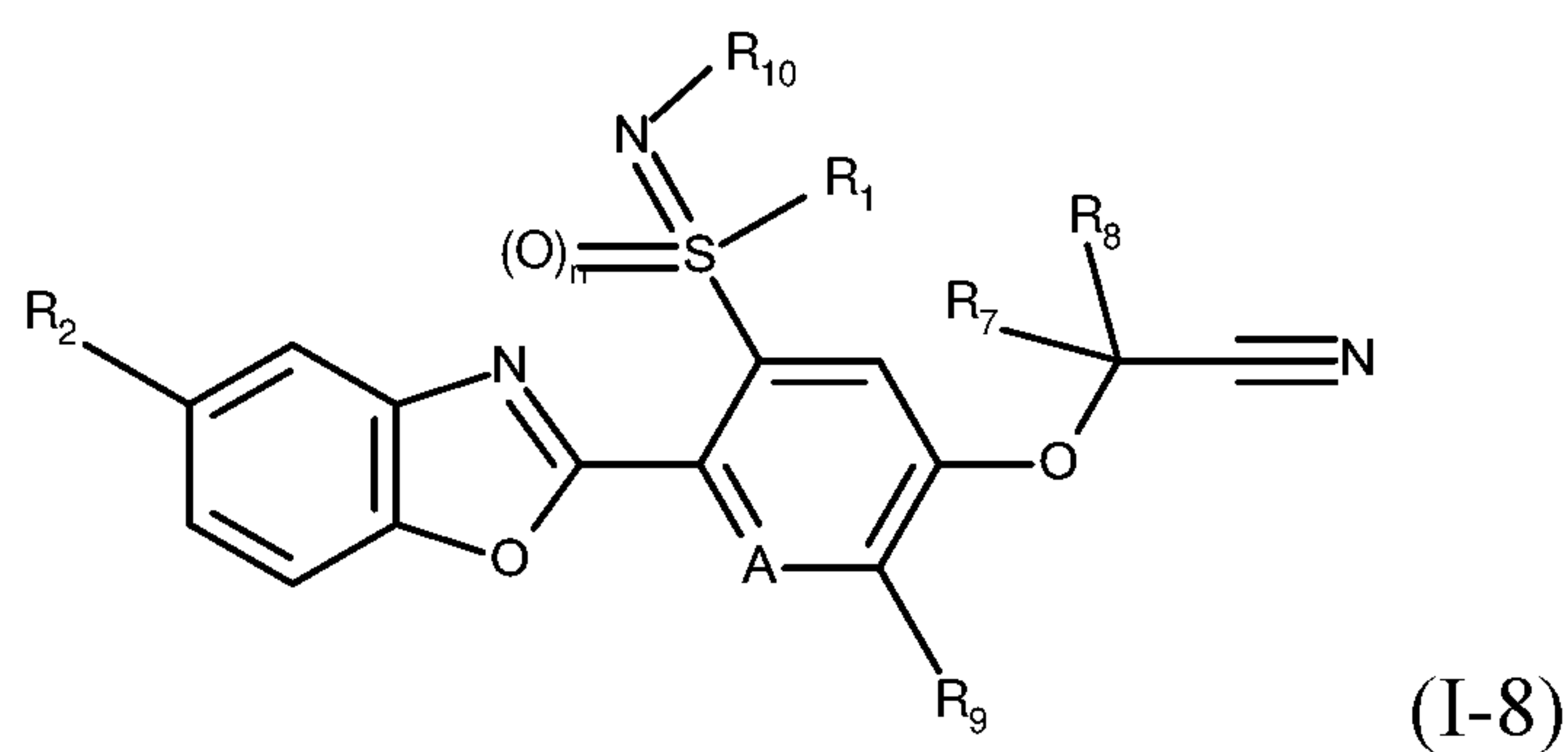
【0092】 在較佳的另一組式I-7的化合物中，A係CH或N； R_1 係乙基； R_2 係 C_1 - C_2 氟烷基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、二氟甲基氫硫基、二氟甲基亞磺醯基、或二氟甲基磺醯基； R_9 係氫或甲基，較佳的是 R_9 係氫； R_{10} 係氫；並且n係1。

【0093】 在較佳的另外一組式I-7的化合物中， R_7 係氫或 C_1 - C_4 烷基；並且 R_8 係 C_1 - C_4 烷基。

【0094】 在較佳的另一組式I-7的化合物中， R_7 係氫、甲基或乙基；並且 R_8 係甲基或乙基；較佳的是 R_7 係甲基；並且 R_8 係甲基。

【0095】 在式I-7的化合物和上述式I-7的化合物的所有較佳的實施方式中，除非另有說明，否則 R_1 、 R_2 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、A和n係如上式I所定義的；較佳的是A係CH或N，更較佳的是A係N； R_2 係三氟甲基、五氟乙基或三氟甲基氫硫基；較佳的是 R_2 係三氟甲基； R_7 係甲基或乙基，較佳的是 R_7 係甲基； R_8 係甲基或乙基，較佳的是 R_8 係甲基； R_9 係氫； R_{10} 係氫；並且n係1。

【0096】 較佳的另一組式I的化合物由式I-8的化合物表示



其中 R_1 、 R_2 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 A 和 n 係如上式I所定義的。

【0097】 在較佳的一組式I-8的化合物中， A 係CH或N； R_1 係乙基、丙基或異丙基； R_2 係 C_1 - C_2 鹵代烷基、 C_1 - C_2 鹵代烷基氫硫基、 C_1 - C_2 鹵代烷基亞磺醯基或 C_1 - C_2 鹵代烷基磺醯基； R_9 係氫、甲基或乙基； R_{10} 係氫、氰基或 $-C(O)R_{25}$ ，其中 R_{25} 係 C_1 - C_2 鹵代烷基並且 n 係1。

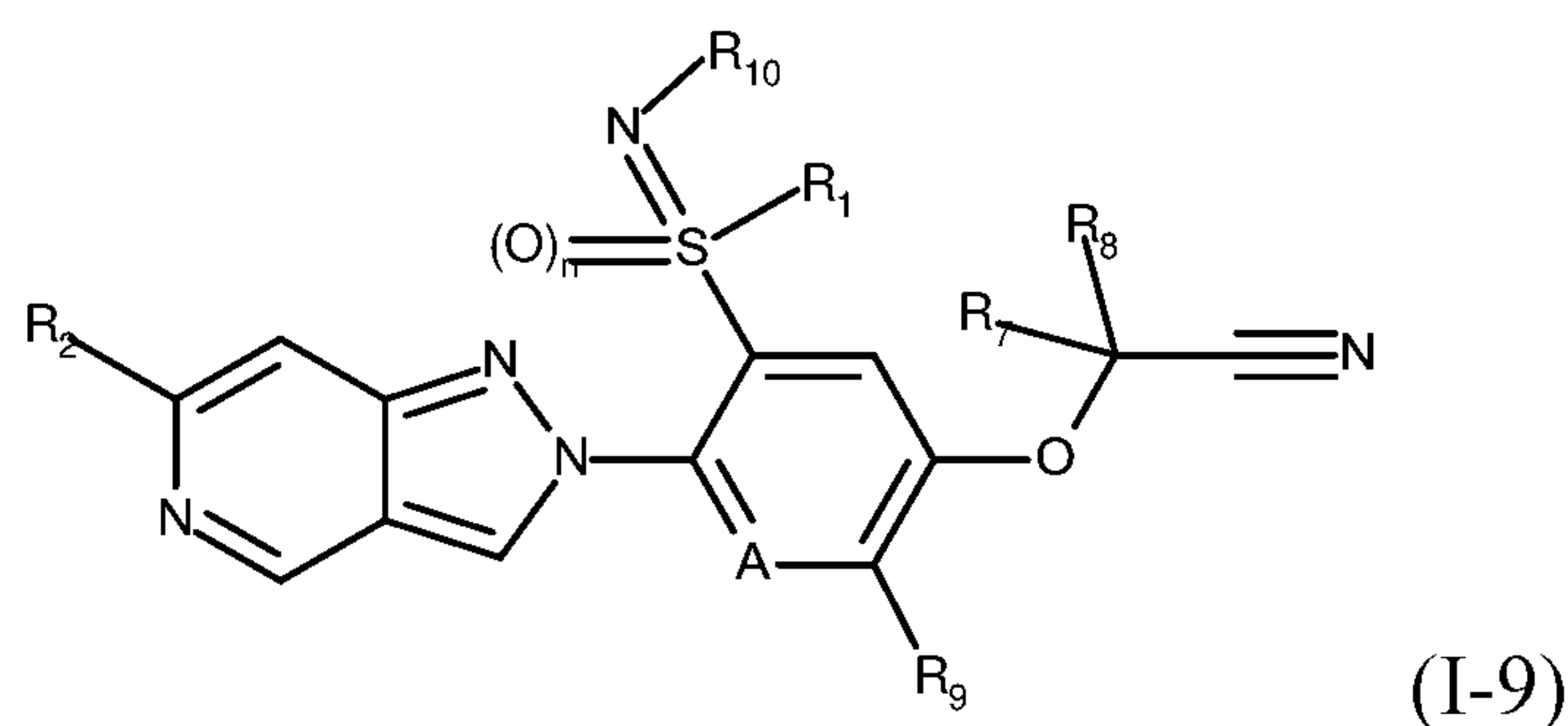
【0098】 在較佳的另一組式I-8的化合物中， A 係CH或N； R_1 係乙基； R_2 係 C_1 - C_2 氟烷基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、二氟甲基氫硫基、二氟甲基亞磺醯基、或二氟甲基磺醯基； R_9 係氫或甲基，較佳的是 R_9 係氫； R_{10} 係氫；並且 n 係1。

【0099】 在較佳的另外一組式I-8的化合物中， R_7 係氫或 C_1 - C_4 烷基；並且 R_8 係 C_1 - C_4 烷基。

【0100】 在較佳的另一組式I-8的化合物中， R_7 係氫、甲基或乙基；並且 R_8 係甲基或乙基；較佳的是 R_7 係甲基；並且 R_8 係甲基。

【0101】 在式I-8的化合物和上述式I-8的化合物的所有較佳的實施方式中，除非另有說明，否則 R_1 、 R_2 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 A 和 n 係如上式I所定義的；較佳的是 A 係CH或N，更較佳的是 A 係N； R_2 係三氟甲基、五氟乙基或三氟甲基氫硫基；較佳的是 R_2 係三氟甲基； R_7 係甲基或乙基，較佳的是 R_7 係甲基； R_8 係甲基或乙基，較佳的是 R_8 係甲基； R_9 係氫； R_{10} 係氫；並且 n 係1。

【0102】 較佳的另一組式I的化合物由式I-9的化合物表示



其中 R_1 、 R_2 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 A 和 n 係如上式I所定義的。

【0103】 在較佳的一組式I-9的化合物中， A 係CH或N； R_1 係乙基、丙基或異丙基； R_2 係 C_1 - C_2 鹵代烷基、 C_1 - C_2 鹵代烷基氫硫基、 C_1 - C_2 鹵代烷基亞磺醯基或 C_1 - C_2 鹵代烷基磺醯基； R_9 係氫、甲基或乙基； R_{10} 係氫、氰基或 $-C(O)R_{25}$ ，其中 R_{25} 係 C_1 - C_2 鹵代烷基並且 n 係1。

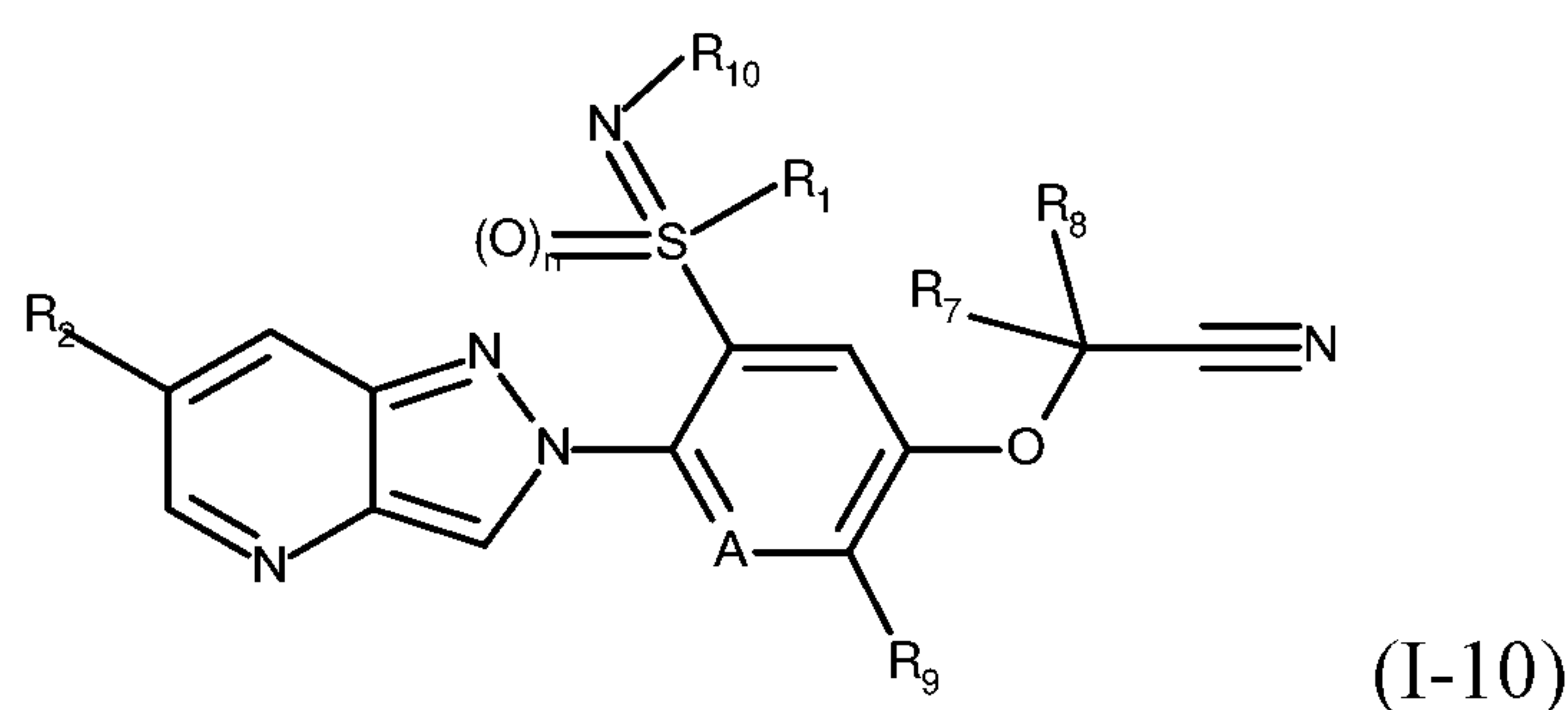
【0104】 在較佳的另一組式I-9的化合物中， A 係CH或N； R_1 係乙基； R_2 係 C_1 - C_2 氟烷基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、二氟甲基氫硫基、二氟甲基亞磺醯基、或二氟甲基磺醯基； R_9 係氫或甲基，較佳的是 R_9 係氫； R_{10} 係氫；並且 n 係1。

【0105】 在較佳的另外一組式I-9的化合物中， R_7 係氫或 C_1 - C_4 烷基；並且 R_8 係 C_1 - C_4 烷基。

【0106】 在較佳的另一組式I-9的化合物中， R_7 係氫、甲基或乙基；並且 R_8 係甲基或乙基；較佳的是 R_7 係甲基；並且 R_8 係甲基。

【0107】 在式I-9的化合物和上述式I-9的化合物的所有較佳的實施方式中，除非另有說明，否則 R_1 、 R_2 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 A 和 n 係如上式I所定義的；較佳的是 A 係CH或N，更較佳的是 A 係N； R_2 係三氟甲基、五氟乙基或三氟甲基氫硫基；較佳的是 R_2 係三氟甲基； R_7 係甲基或乙基，較佳的是 R_7 係甲基； R_8 係甲基或乙基，較佳的是 R_8 係甲基； R_9 係氫； R_{10} 係氫；並且 n 係1。

【0108】 較佳的另一組式I的化合物由式I-10的化合物表示



其中 R_1 、 R_2 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 A 和 n 係如上式I所定義的。

【0109】 在較佳的一組式I-10的化合物中， A 係CH或N； R_1 係乙基、丙基或異丙基； R_2 係 C_1 - C_2 鹵代烷基、 C_1 - C_2 鹵代烷基氫硫基、 C_1 - C_2 鹵代烷基亞磺醯基或 C_1 - C_2 鹵代烷基磺醯基； R_9 係氫、甲基或乙基； R_{10} 係氫、氰基或 $-C(O)R_{25}$ ，其中 R_{25} 係 C_1 - C_2 鹵代烷基並且 n 係1。

【0110】 在較佳的另一組式I-10的化合物中， A 係CH或N； R_1 係乙基； R_2 係 C_1 - C_2 氟烷基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、二氟甲基氫硫基、二氟甲基亞磺醯基、或二氟甲基磺醯基； R_9 係氫或甲基，較佳的是 R_9 係氫； R_{10} 係氫；並且 n 係1。

【0111】 在較佳的另外一組式I-10的化合物中， R_7 係氫或 C_1 - C_4 烷基；並且 R_8 係 C_1 - C_4 烷基。

【0112】 在較佳的另一組式I-10的化合物中， R_7 係氫、甲基或乙基；並且 R_8 係甲基或乙基；較佳的是 R_7 係甲基；並且 R_8 係甲基。

【0113】 在式I-10的化合物和上述式I-10的化合物的所有較佳的實施方式中，除非另有說明，否則 R_1 、 R_2 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 A 和 n 係如上式I所定義的；較佳的是 A 係CH或N，更較佳的是 A 係N； R_2 係三氟甲基、五氟乙基或三氟甲基氫硫基；較佳的是 R_2 係三氟甲基； R_7 係甲基或乙基，較佳的是 R_7 係甲基； R_8 係甲基或乙基，較佳的是 R_8 係甲基； R_9 係氫； R_{10} 係氫；並且 n 係1。

【0114】 特別較佳的另一組式I的化合物係由式I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9或I-10的化合物表示的那些，其中

A係CH或N，較佳的是A係N；

R₁係乙基、丙基或異丙基；較佳的是乙基；

R₂係三氟甲基、五氟乙基或三氟甲基氫硫基；較佳的是R₂係三氟甲基；

R₉和R₁₀均是氫；並且

n係1；並且

在式I-1、I-2、I-3、和I-4的化合物的情況下，R₃係甲基；並且在式I-4的化合物的情況下，R₄係乙基或環丙基；並且

其中在所述特別較佳的一組式I的化合物中，較佳的是R₇係氫、甲基或乙基；並且R₈係甲基或乙基；較佳的是R₇係甲基；並且R₈係甲基。

【0115】 根據本發明的化合物可具有任何數量的益處，尤其包括針對保護植物免受昆蟲侵害的有利的生物活性水平或作為農用化學活性成分使用的優異特性（例如，較大的生物活性、有利的活性範圍、增加的安全性特徵、改進的理化特性、或增加的生物降解性或環境特徵）。具體而言，現已出人意料地發現對於非靶標節肢動物，特別是傳粉者（諸如蜜蜂、獨居蜜蜂和熊蜂），某些式(I)之化合物可以顯示出有利的安全性特徵。最特別地，係對於義大利蜂（*Apis mellifera*）。

【0116】 在另一方面，本發明提供了一種組成物，其包含殺昆蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物有效量的如在實施方式1-28（以上）中任一項或式I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9或I-10的化合物的實施方式中任一項中所定義的式(I)之化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，以及視需要的助劑或稀釋劑。

【0117】 在另外的方面，本發明提供了一種對抗和防治昆蟲、蟎、線蟲或軟體動物之方法，該方法包括將殺昆蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物有效量的如在實施方式1-28（以上）中任一項或式I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、

I-9或I-10（以上）的實施方式中任一項化合物所定義的式(I)之化合物或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，或如上所定義的組成物施用於有害生物、有害生物場所、或易受有害生物攻擊的植物。

【0118】 在又另一方面，本發明提供了一種用於保護植物繁殖材料免受昆蟲、蟎、線蟲或軟體動物攻擊之方法，該方法包括用如上所定義的組成物處理該繁殖材料或種植該繁殖材料的地點。

【圖式簡單說明】

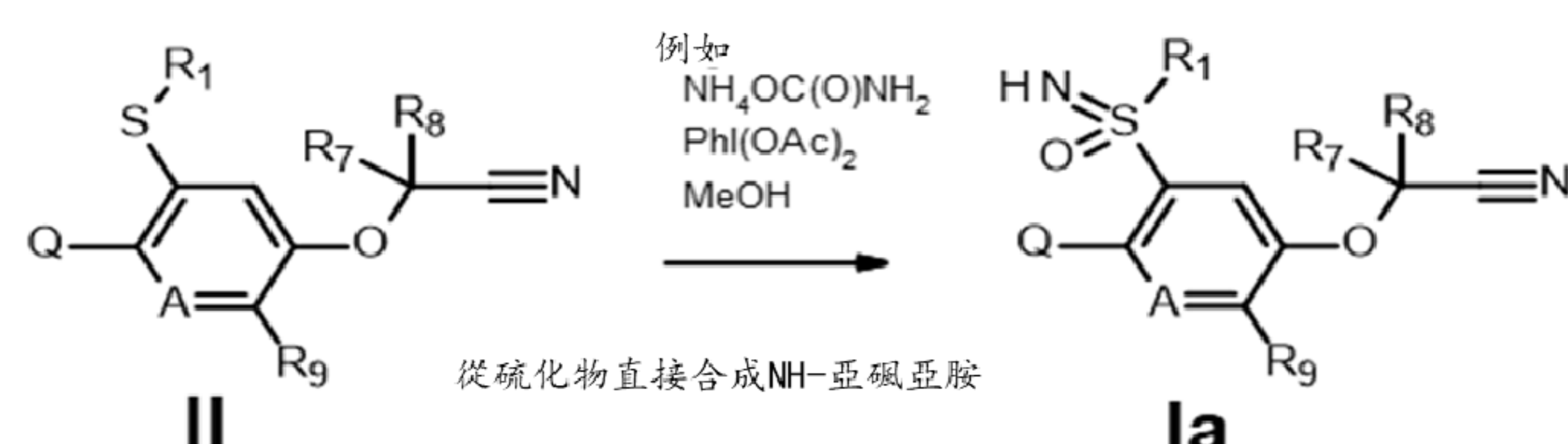
無

【實施方式】

【0119】 根據本發明的用於製備式I的化合物的方法藉由熟悉該項技術者已知的方法進行。

【0120】 其中 R_{10} 係氫並且 n 係1的式I的化合物（定義式Ia的化合物）的亞組，其中 R_9 、 R_1 、 R_7 、 R_8 、A和Q係如式I中所定義的，

流程1：

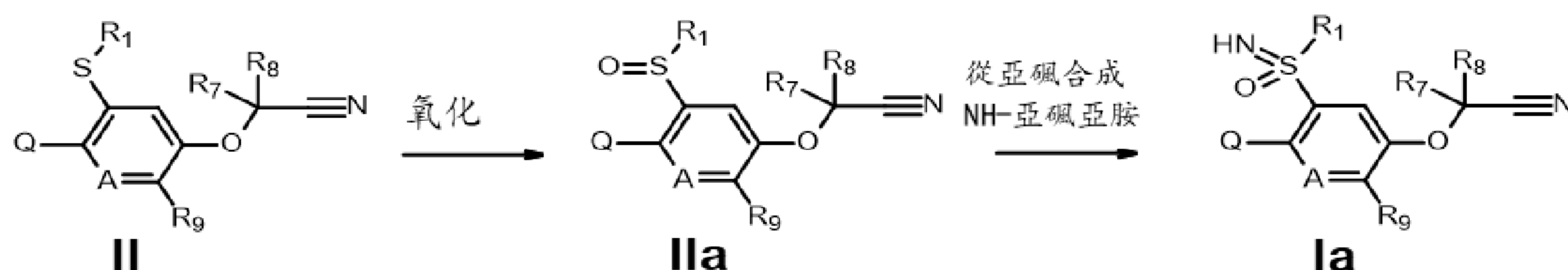


可以藉由以下方式來製備（流程1）：使其中 R_9 、 R_1 、 R_7 、 R_8 、A和Q係如式I中所定義的式II的硫化物與合適的氮源（例如像氨、胺基甲酸銨或乙酸銨（較佳的是胺基甲酸銨））在諸如二乙醯氧基碘苯的超價碘試劑的存在下在諸如甲苯、乙腈或甲醇的溶劑中在 0°C 與 100°C 之間的溫度下（較佳的是在室溫附近）反應，類似於例如在Chem. Commun. [化學通訊] 53, 348-351; 2017（和其中引用的參考

文獻) 中找到的描述。

【0121】 可替代地，式Ia的化合物，其中 R_9 、 R_1 、 R_7 、 R_8 、A和Q係如式I中所定義的，

流程2：

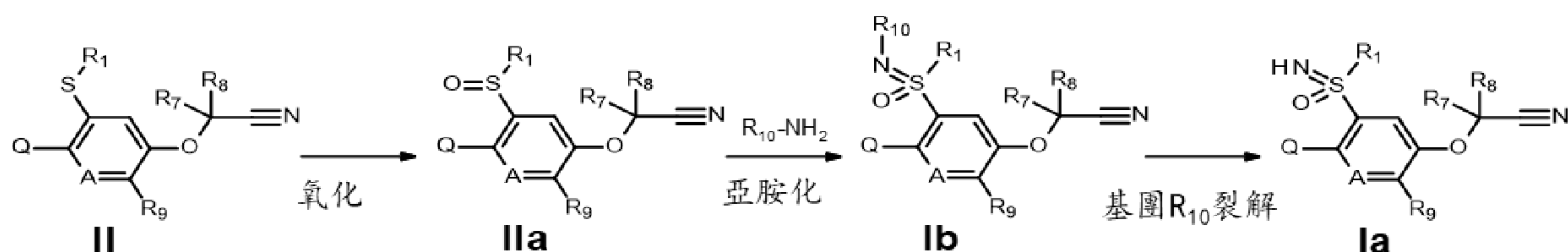


可以藉由以下方式來製備（流程2）：在以上針對將式II的化合物轉化為式Ia的化合物所說明的類似條件下使其中 R_9 、 R_1 、 R_7 、 R_8 、A和Q係如式I中所定義的式IIa的亞磺化合物反應，類似於例如Angewandte Chemie, International Edition [德國應用化學國際版], 55, 7203-7207; 2016（和其中引用的參考文獻）中找到的描述。

【0122】 其中 R_9 、 R_1 、 R_7 、 R_8 、A和Q係如式I中所定義的式IIa的化合物可以借助式II的對應硫化物化合物的氧化反應來獲得，該氧化反應涉及除其他氧化劑之外的試劑例如像間氯過氧苯甲酸（mCPBA）、過氧化氫、過氧單硫酸鉀鹽（oxone）、過碘酸鈉、次氯酸鈉或次氯酸三級丁酯。該氧化反應通常是在溶劑的存在下進行的。用於該反應的溶劑的實例包括脂族鹵化烴，諸如二氯甲烷和氯仿；醇，諸如甲醇和乙醇；乙酸；水；及其混合物。用於該反應的氧化劑的量較佳的是係相對於1莫耳硫化物化合物II，1至1.2莫耳，以產生亞磺化合物IIa。

【0123】 其中n係1的式I的化合物（定義式Ib的化合物）的亞組，其中 R_9 、 R_{10} 、 R_1 、 R_7 、 R_8 、A和Q係如式I中所定義的，

流程3：



可以藉由以下方式來製備（流程3）：使其中 R_9 、 R_1 、 R_7 、 R_8 、A和Q係如式I中

所定義的式IIa的化合物經受亞胺化反應條件，如例如在H. Okamura, C. Bolm, Org. Lett. [有機快報] 2004, 6, 1305-1307；H. Okamura, C. Bolm, Chem. Lett. [化學快報] 2004, 33, 482-487；D. Leca, K. Song, M. Amatore, L. Fensterbank, E. Lacôte, M. Malacria, Chem. Eur [歐洲化學]. J. 2004, 10, 906-916；或M. Reggelin, C. Zur, Synthesis [合成], 2000, 1-64中所描述的。典型的亞胺化試劑/條件可以定義為 $\text{NaN}_3/\text{H}_2\text{SO}_4$ 、O-均三甲苯磺醯基-羥胺（MSH）或金屬催化方法 [參見O.G. Mancheno, C. Bolm, Chem. Eur. [歐洲化學] J. 2007, 13, 6674-6681]，諸如 $\text{R}_{10}\text{-N}_3/\text{FeCl}_2$ 、 $\text{R}_{10}\text{-NH}_2/\text{Fe}(\text{acac})_3/\text{PhI}=\text{O}$ 、 $\text{PhI}=\text{N-R}_{10}/\text{Fe}(\text{OTf})_2$ 、 $\text{PhI}=\text{N-R}_{10}/\text{CuOTf}$ 、 $\text{PhI}=\text{N-R}_{10}/\text{Cu}(\text{OTf})_2$ 、 $\text{PhI}=\text{N-R}_{10}/\text{CuPF}_6$ 、 $\text{PhI}(\text{OAc})_2/\text{R}_{10}\text{-NH}_2/\text{MgO}/\text{Rh}_2(\text{OAc})_4$ 或氧氮環丙烷（oxaziridine）（例如，3-(4-氰基-苯基)-氧氮環丙烷-2-甲酸三級丁酯）。

【0124】 特別感興趣的是無金屬亞胺化方法，其涉及 $\text{R}_{10}\text{-NH}_2$ 和氧化劑，例如 $\text{PhI}(\text{OAc})_2/\text{R}_{10}\text{-NH}_2$ ，如G.Y. Cho, C. Bolm, Tetrahedron Lett. [四面體快報] 2005, 46, 8007-8008中所描述的；或N-溴琥珀醯亞胺（NBS）/ $\text{R}_{10}\text{-NH}_2$ 和諸如三級丁醇鈉或三級丁醇鉀的鹼，如C. Bolm等人, Synthesis [合成] 2010, 第17期, 2922-2925中所描述的。也可以替代性地使用氧化劑諸如N-碘琥珀醯亞胺（NIS）或碘，如例如在O.G. Mancheno, C. Bolm, Org. Lett. [有機快報] 2007, 9, 3809-3811中所描述的。WO 2008/1060中描述了用作氧化劑的次氯酸鹽的實例，諸如次氯酸鈉 NaOCl 或次氯酸鈣 $\text{Ca}(\text{OCl})_2$ 。

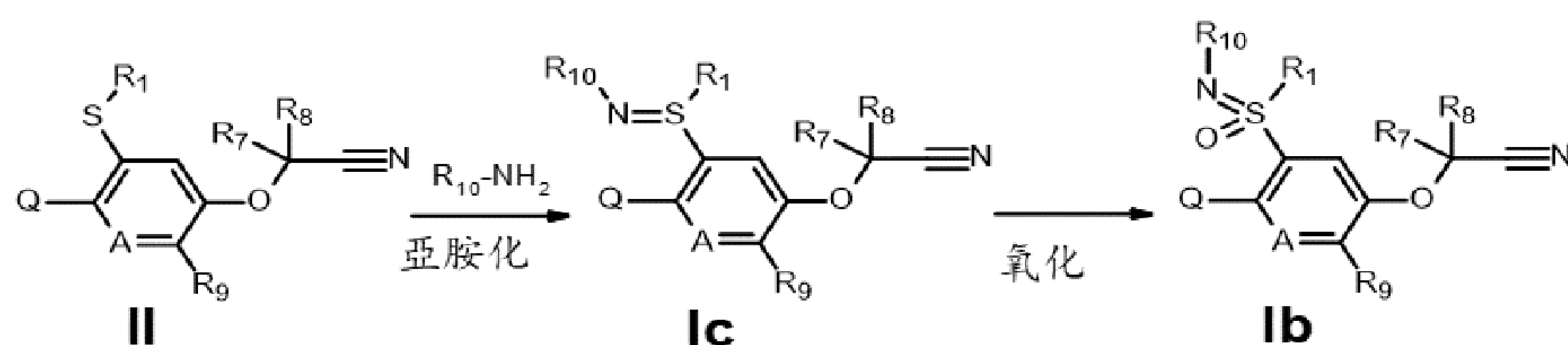
【0125】 可以藉由用三氟乙酸酐在諸如二氯甲烷的溶劑中的處理將其中 R_9 、 R_1 、 R_7 、 R_8 、A和Q係如上所定義的並且其中 R_{10} 係CN的式Ib的化合物轉化為其中 R_{10} 係 $\text{C}(\text{O})\text{CF}_3$ 的式Ib的化合物，如例如在O.G. Mancheno, C. Bolm, Org. Lett. [有機快報] 2007, 9, 3809-3811中所描述的。

【0126】 可以藉由在諸如甲醇或乙醇的極性質子溶劑中用諸如碳酸鈉或碳酸鉀的鹼的處理將其中 R_9 、 R_1 、 R_7 、 R_8 、A和Q係如上所定義的並且其中 R_{10}

係C(O)CF₃的式Ib的化合物轉化為其中R₁₀係氫(R₁₀裂解)的式Ib的化合物，如例如在H. Okamura, C. Bolm, Org. Lett. [有機快報] 2004, 6, 1305-1307中所描述的。

【0127】 相反，可以恢復兩個氧化/亞胺化步驟的順序，如流程4所示。

流程4：

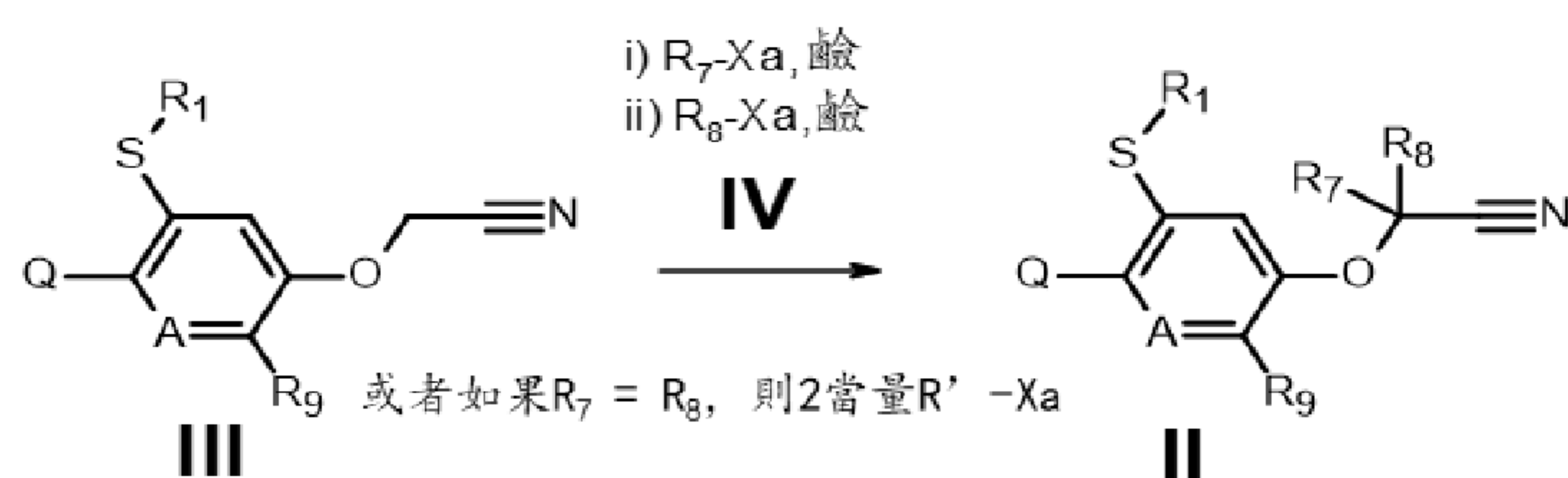


式Ic的化合物(為其中n係0並且其中其他取代基係如流程3中所定義的式I的化合物的亞組)的氧化，以提供式Ib的化合物，可以在以上已經描述的條件下實現或者可替代地涉及例如KMnO₄、NaMnO₄、mCPBA、NaIO₄/RuO₂、NaIO₄/RuCl₃、H₂O₂、過氧單硫酸鉀鹽。具體而言，WO 2008/097235和WO 2008/106006中描述了使用與鹼金屬過碘酸鹽組合的鈎鹽和可替代地使用鹼金屬過錳酸鹽。

【0128】 其中R₉、R₁₀、R₁、R₇、R₈、A和Q係如式I中所定義的式Ic的化合物可藉由以下方式來製備：使其中R₉、R₁、R₇、R₈、A和Q係如式I中所定義的式II的化合物經受亞胺化反應條件，如以上流程3中所描述的。

【0129】 其中R₉、R₁、R₇、R₈、A和Q係如式I中所定義的式II的化合物

流程5：

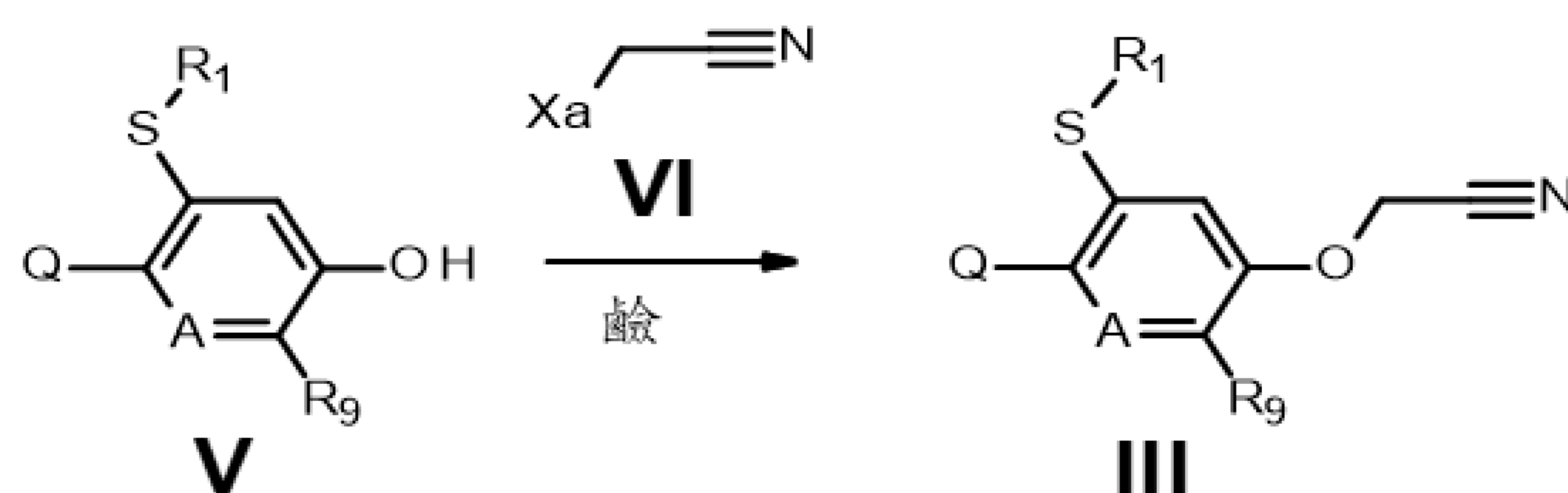


可以藉由以下方式來製備(流程5)：在例如像碳酸鉀、碳酸鈉、六甲基二矽氮烷鋰或二異丙基胺基鋰的鹼的存在下在諸如乙腈、四氫呋喃或N,N-二甲基甲醯胺的合適溶劑中在-78°C與100°C之間、較佳的是在-10°C與80°C之間的溫度下使其中R₉、R₁、A和Q係如式I中所定義的式III的化合物與其中R₇和R₈係如式I中所定義的並且其中Xa係脫離基(例如像氯、溴或碘(較佳的是碘或溴)，或芳基-

烷基-或鹵代烷基磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式IV的化合物反應，如例如在Bioorganic & Medicinal Chemistry [生物有機及藥物化學], 20(18), 5600-5615; 2012中所描述的。較佳的是，用通式IV的R₇Xa和R₈Xa的烷基化試劑依次處理式III的化合物。在R₇和R₈同等的特定情況下，可以使式III的化合物經受過量的上述鹼和試劑R'Xa IV，其中Xa係如上所定義的並且其中R₇=R₈=R'。

其中R₉、R₁、A和Q係如式I中所定義的式III的化合物

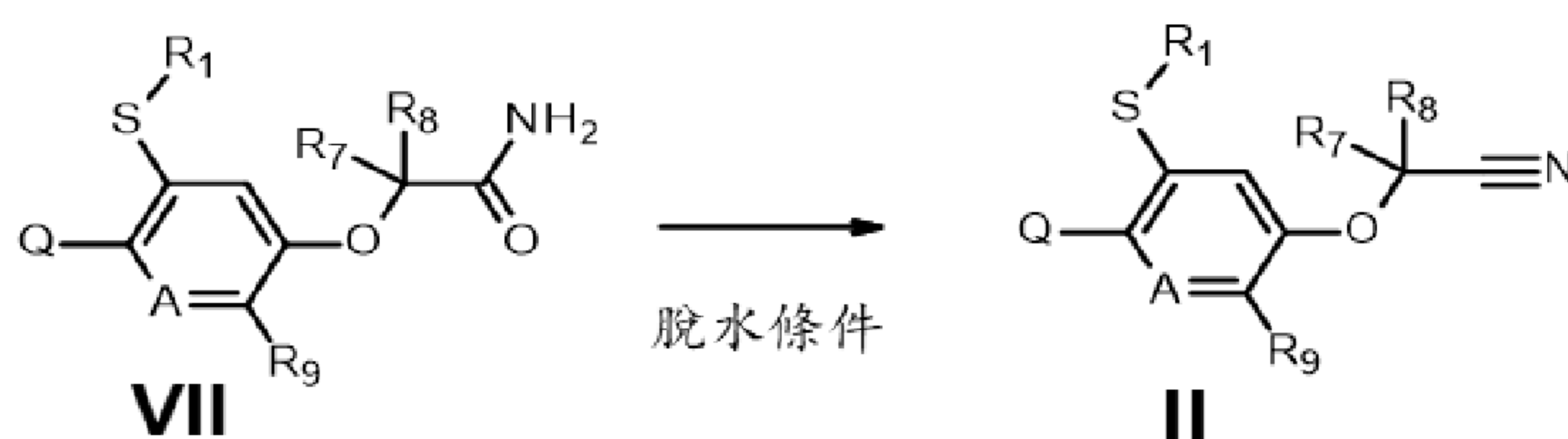
流程6：



可以藉由以下方式來製備（流程6）：在例如像碳酸鉀、碳酸銻或氫化鈉的鹼的存在下視需要在催化劑量的諸如碘化鈉或碘化鉀的添加劑的存在下在諸如丙酮、四氫呋喃、乙腈、二甲基亞砷或N,N-二甲基甲醯胺的合適溶劑中在-10°C與100°C之間、較佳的是在0°C與80°C之間的溫度下使其中R₉、R₁、A和Q係如式I中所定義的式V的化合物與其中Xa係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是氯或溴），或芳基-、烷基-或鹵代烷基磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式VI的化合物反應，如例如在Tetrahedron Letters [四面體快報], 34(47), 7567-8; 1993中所描述的。

【0130】 可替代地，其中R₉、R₁、R₇、R₈、A和Q係如式I中所定義的式II的化合物

流程7：

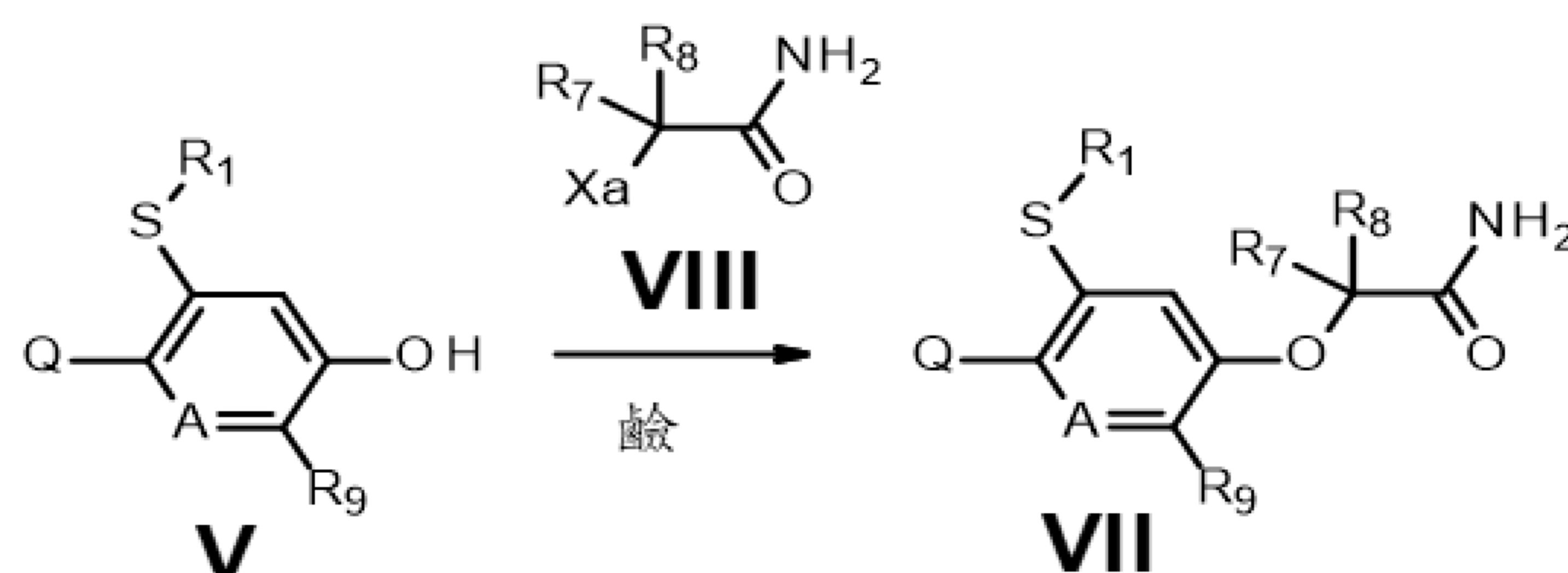


可以在脫水條件下藉由以下方式來製備（流程7）：視需要在諸如三乙胺或吡啶

的鹼的存在下在例如像二氯甲烷、二噁吡或N,N-二甲基甲醯胺的適當溶劑中在0°C與180°C之間、較佳的是在5°C與80°C之間的溫度下使其中R₉、R₁、R₇、R₈、A和Q係如式I中所定義的式VII的化合物與諸如三氟乙酸、三氟乙酸酐、五氧化二磷、亞硫醯氯或三氯氧磷的脫水劑反應，如例如在US 20100267738中所描述的。

其中R₉、R₁、R₇、R₈、A和Q係如式I中所定義的式VII的化合物

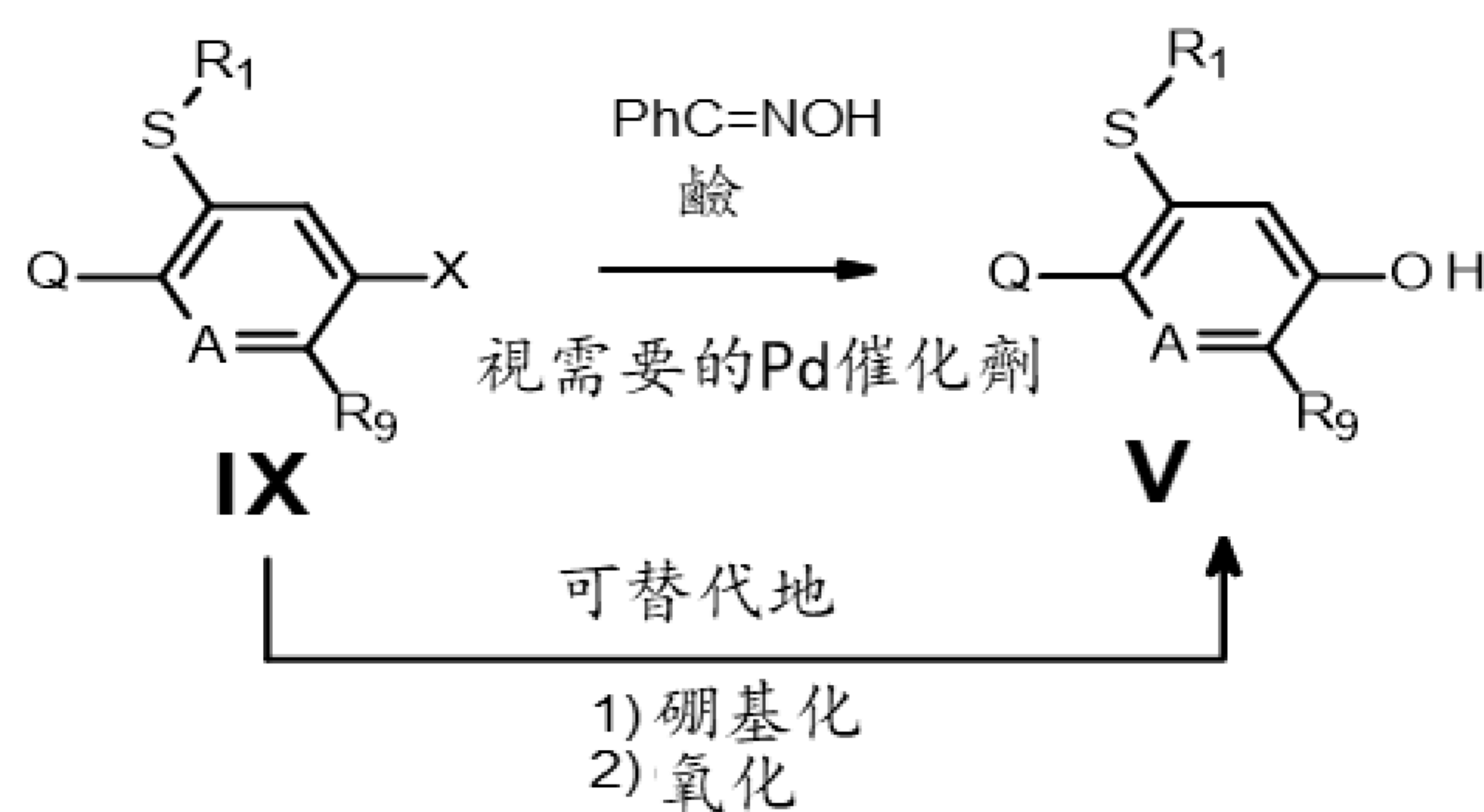
流程8：



可以藉由以下方式來製備（流程8）：在例如像氫氧化鋰、氫氧化鈉或氫氧化鉀，氫化鈉，碳酸鉀或碳酸鈉的鹼的存在下在諸如丙酮、二噁吡、乙腈、N,N-二甲基甲醯胺或N,N-二甲基乙醯胺的合適溶劑中在-10°C與100°C之間、較佳的是在0°C與80°C之間的溫度下使其中R₉、R₁、A和Q係如式I中所定義的式V的化合物與其中R₇和R₈係如式I中所定義的並且其中Xa係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是溴），或芳基-、烷基-或鹵代烷基磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式VIII的化合物反應，如例如在WO 2014071044中所描述的。

【0131】 其中R₉、R₁、A和Q係如式I中所定義的式V的化合物

流程9：



可以藉由以下方式來製備（流程9）：在諸如碳酸鉀或碳酸鈉的鹼的存在下，視需要在鈀催化劑（諸如RockPhos-G3-環鈀配合物（[(2-二-三級丁基膦基-3-甲氧基-6-甲基-2',4',6'-三異丙基-1,1'-二苯基)-2-(2-胺基二苯基)]甲磺酸鈀(II)）的存在下在諸如乙腈或N,N-二甲基甲醯胺DMF的非質子溶劑中在0與100°C之間、較佳的是在室溫與80°C之間的溫度下使其中R₉、R₁、A和Q係如式I中所定義的並且其中X係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是溴），或芳基-、烷基-或鹵代烷基磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式IX的化合物與例如苯甲醛肟PhC=NOH（較佳的是(E)-苯甲醛肟）反應，如例如在Angew. Chem. Int. Ed [應用化學國際版]. 56 (16), 4478-4482, 2017中所描述的。

【0132】 可替代地，其中R₉、R₁、A和Q係如式I中所定義的式V的化合物可以由其中R₉、R₁、A和Q係如式I中所定義的並且其中X係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是溴），或芳基-、烷基-或鹵代烷基磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式IX的化合物藉由依次運行以下來製備：

1) 硼基化反應，其中典型地使式IX的化合物與雙頻哪醇二硼烷(Bpin)₂在鈀催化下反應。此類頻哪醇硼酸酯官能基的引入可以在諸如二噁啉的非質子溶劑中在鹼（較佳的是弱鹼，組如乙酸鉀KOAc）的存在下進行。[1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵]二氯化鈀(II)，也稱為二氯化鈀dppf或Pd(dppf)Cl₂，係用於此類反應的常用催化劑。其他鈀源/配位基組合涉及例如三(二亞苄基丙酮)二鈀和三環己基膦。該反應的溫度較佳的是在0°C與反應混合物的沸點之間進行，或者該反應可以在微波照射下進行。然後使此硼基化反應的中間體產物進一步經受

2) 氧化步驟，其中典型地在0與100°C之間、較佳的是在室溫附近的溫度下在諸如四氫呋喃或二噁吡的惰性溶劑中用過氧化氫 H_2O_2 （例如在水中的30% H_2O_2 溶液）處理所述中間產物。從式IX的化合物製備式V的化合物的所述方法可以包括硼基化中間體的分離和純化，但是此方法也有利地藉由將所述粗中間體接入氧化步驟2中來進行。

【0133】 其中 R_9 、 R_1 、A和Q係如式I中所定義的並且其中X係脫離基的式IX的化合物，特別是其中X係鹵素的那些化合物係已知化合物，或可以藉由已知方法製備，或者可以與在文獻中找到的描述的方法類似地合成。特別參見WO 2016/071214（Q係 Q_2 ， G_2 係N）和WO 2015/000715（Q係 Q_2 ， G_2 係CH）、WO 2016/026848和WO 2016/005263（Q係 Q_1 ， G_1 係CH， G_2 係N）、WO 2016/059145（Q係 Q_1 ， G_1 係N， G_2 係N）、WO 2016/020286和WO 2017/134066（Q係 Q_4 ）、WO 2017/089190、WO 2017/084879和WO 2016/023954（Q係 Q_5 ）、WO 2015/000715（Q係 Q_3 ）、和WO 2012/086848、WO 2013/018928（Q係 Q_1 ， G_1 係N或CH， G_2 係CH）。

【0134】 其中 R_7 和 R_8 係如式I中所定義的並且其中Xa係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是碘或溴），或芳基-、烷基-或鹵代烷基磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式IV的化合物；和

在其中 $R_7=R_8=R'$ 的特定情況下，其中 R_7 和 R_8 係如式I中所定義的並且其中Xa係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是氯或溴），或芳基-、烷基-或鹵代烷基磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式R'-Xa IV的化合物；和

其中Xa係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是溴），或芳基-、烷基-或鹵代烷基磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式VI的化合物；和

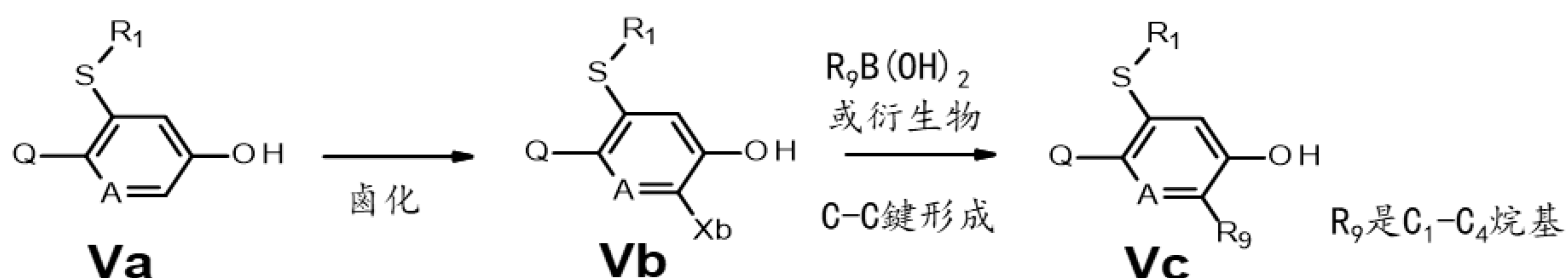
其中 R_7 和 R_8 係如式I中所定義的並且其中Xa係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是溴），或芳基-、烷基-或鹵代烷基磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式VIII

的化合物；

都或者是已知的化合物，可商購獲得，或者可以藉由文獻中描述的已知方法製備。

【0135】 其中 R_9 係 C_1 - C_4 烷基的式V的化合物（定義式Vc的化合物）的亞組，其中 R_1 、A和Q係如式I中所定義的，

流程10：

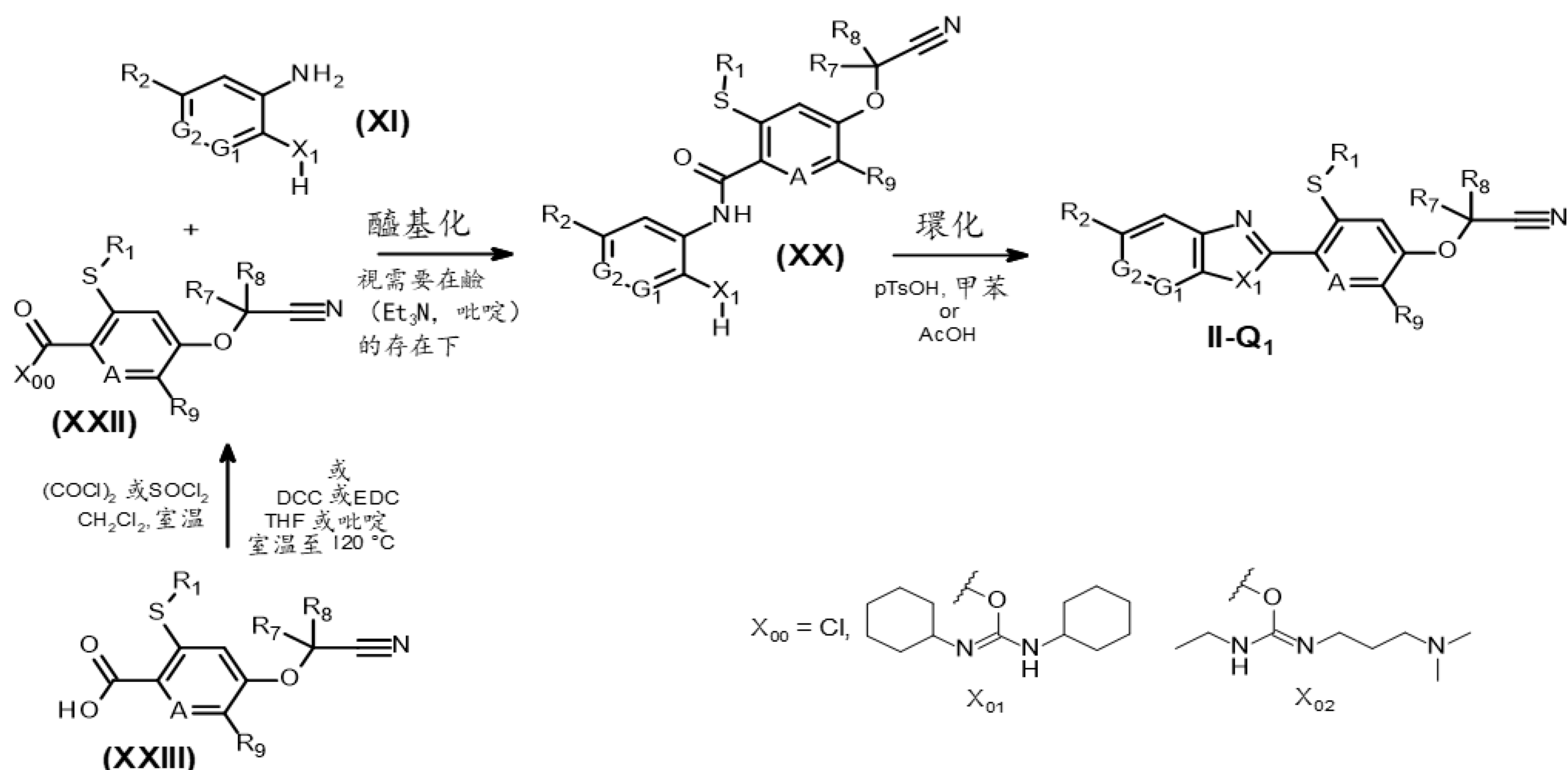


可以由其中 R_1 、A和Q係如式I中所定義的並且其中 Xb 係鹵素，較佳的是氯、溴或碘的式Vb的化合物借助典型地在鈣催化（可替代地是鎳催化）的交叉偶合條件下的C-C鍵生成反應來製備（流程10）。式Vb的化合物與其中 R_9 係如式I中所定義的式 $R_9B(OH)_2$ 的 C_1 - C_4 烷基硼酸、或相應的 C_1 - C_4 烷基硼酸酯衍生物、或其中 R_9 係如式I中所定義的式 $(R_9BO)_3$ 的相應的6元三(C_1 - C_4 烷基)硼氧六環（boroxine）衍生物之間的此類鈴木-宮浦（Suzuki-Miyaura）交叉偶合反應係熟悉該項技術者熟知的。在 R_9 係甲基的特定情況下，可以在諸如四(三苯基膦)-鈣(0)或[1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵]二氯化鈣(II)二氯甲烷錯合物的鈣催化劑和諸如碳酸鈉或碳酸鉀的鹼的存在下在諸如N,N-二甲基甲醯胺、二噁吡喃或二噁吡喃-水混合物的溶劑中在室溫與 160°C 之間的溫度下、視需要在微波加熱條件下並且較佳的是在惰性氣氛下使式Vb的化合物例如與三甲基硼氧六環（也稱為2,4,6-三甲基-1,3,5,2,4,6-三氧雜硼環己烷）反應。例如在Tetrahedron Letters [四面體通訊] (2000), 41(32), 6237-6240中描述了此類條件。

【0136】 其中 R_1 、A和Q係如式I中所定義的並且其中 Xb 係鹵素，較佳的是氯、溴或碘的式Vb的化合物可以藉由鹵化反應製備，該鹵化反應涉及例如，視

需要在諸如碳酸鈉、碳酸鉀或碳酸銨的鹼的存在下，使其中R₉係氫的式V的化合物（定義式Va的化合物）的亞組（其中R₁、A和Q係如式I中所定義的）與鹵化試劑（諸如N-氯琥珀醯亞胺（NCS）、N-溴琥珀醯亞胺（NBS）或N-碘-琥珀醯亞胺（NIS），或可替代地氯、溴或碘）反應。此類鹵化反應在諸如氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷、乙酸、醚、N,N-二甲基甲醯胺、乙腈或乙腈-水混合物的惰性溶劑中在20°C-200°C之間、較佳的是室溫至100°C的溫度下進行。

可替代地，其中Q為Q₁的式II的化合物（定義式II-Q₁的化合物），其中R₁、R₉、R₇、R₈、A、X₁、G₁、G₂和R₂係如式I中所定義的，
流程11：



可以藉由以下方式來製備（流程11）：例如藉由在0°C與180°C之間、較佳的是在20°C與150°C之間的溫度下，視需要在微波照射下在乙酸或三氟乙酸中加熱（較佳的是當X₁係其中R₃係C₁-C₄烷基的NR₃時），使其中R₁、R₉、R₇、R₈、A、X₁、G₁、G₂和R₂係如式I中所定義的式 (XX) 之化合物環化。也可以在25°C-180°C之間、較佳的是100°C-170°C的溫度下在諸如N-甲基吡咯啉酮、甲苯或二甲苯的惰性溶劑中在酸催化劑（例如甲磺酸或對甲苯磺酸p-TsOH）的存在下實現式 (XX) 之化合物的環化。此類方法先前已經描述於例如WO 2010/125985中。可替

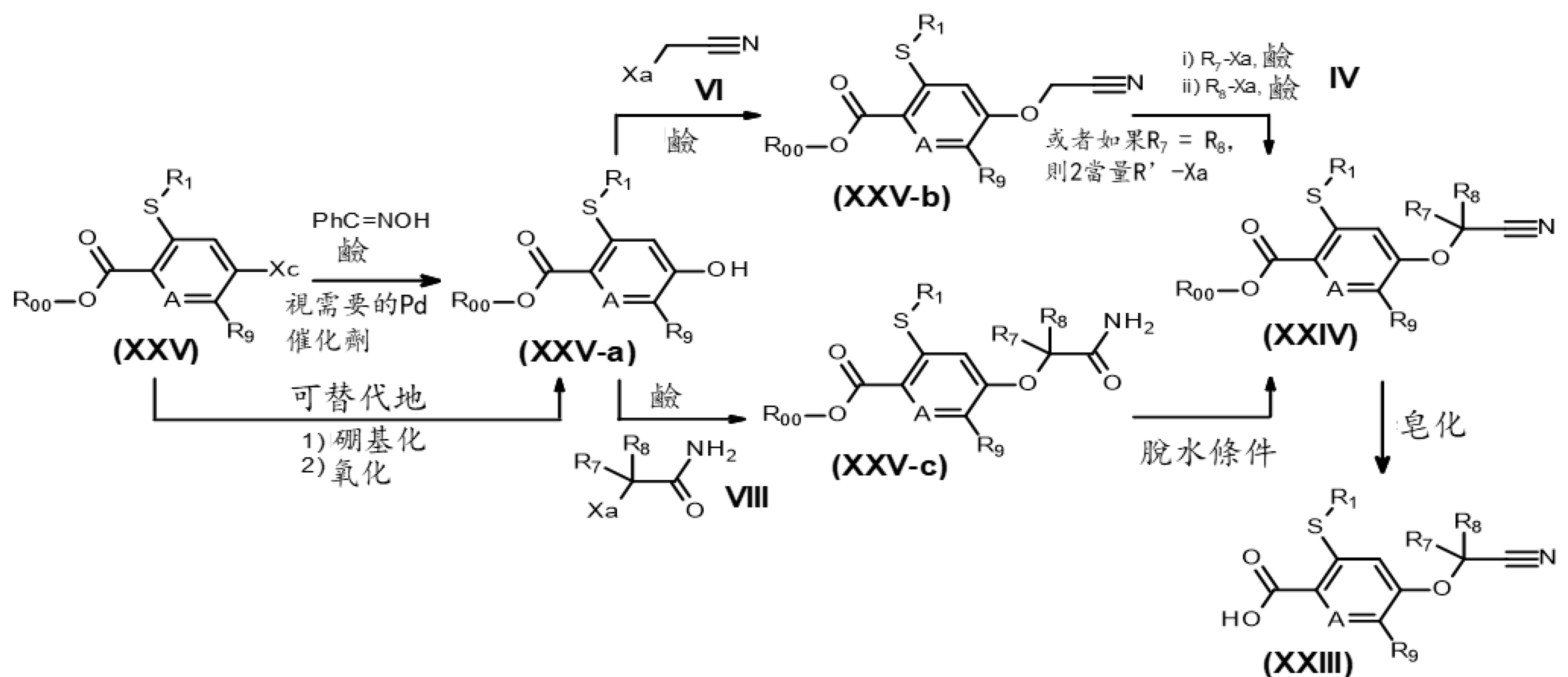
代地，可以在20°C-50°C之間的溫度下在諸如四氫呋喃THF的惰性溶劑中，使用三苯基磷、偶氮二甲酸二異丙酯（或偶氮二甲酸二乙酯）將式 (XX) 之化合物轉化成式II-Q1的化合物（較佳的是當X₁係O時）。先前已經針對該等轉化描述了此類光延反應條件（參見WO 2009/131237）。

【0137】 其中R₁、R₉、R₇、R₈、A、X₁、G₁、G₂和R₂係如式I中所定義的式 (XX) 之化合物可以藉由以下方式經由醯化來製備：

i) 藉由熟悉該項技術者已知的和例如Tetrahedron [四面體], 2005, 61 (46), 10827-10852中描述的方法將其中R₁、R₉、R₇、R₈和A係如式I中所定義的式 (XXIII) 之化合物活化，以形成其中R₁、R₉、R₇、R₈和A係如式I中所定義的並且其中X₀₀係鹵素，較佳的是氯的活化物質 (XXII)。例如，其中X₀₀係鹵素，較佳的是氯的化合物 (XXII) 係藉由在20°C至100°C之間、較佳的是25°C的溫度下在諸如二氯甲烷CH₂Cl₂或四氫呋喃THF的惰性溶劑中在催化量的N,N-二甲基甲醯胺DMF的存在下用例如草醯氯(COCl)₂或亞硫醯氯SOCl₂處理 (XXIII) 而形成的。可替代地，在50°C-180°C之間的溫度下，視需要在諸如三乙胺的鹼的存在下在諸如吡啶或四氫呋喃THF的惰性溶劑中，用例如1-乙基-3-(3-二甲基胺基丙基)碳二亞胺EDC或二環己基碳二亞胺DCC處理式 (XXIII) 之化合物將生成其中X₀₀分別是X₀₁或X₀₂的活化物質 (XXII)；隨後

ii) 在0°C與50°C之間的溫度下在諸如二氯甲烷、四氫呋喃、二噁吡、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、乙腈、乙酸乙酯或甲苯的惰性溶劑中在諸如三乙胺、N,N-二異丙基乙胺或吡啶的鹼的存在下用其中X₁、G₂、G₂和R₂係如式I中所定義的式 (XI) 之化合物處理活化物質 (XXII) 以形成式 (XX) 之化合物。

【0138】 其中R₁、R₉、R₇、R₈和A係如式I中所定義的式 (XXIII) 之化合物
流程12：



可以藉由以下方式來製備（流程12）：在熟悉該項技術者已知的條件下（例如使用諸如以下的條件：甲醇、乙醇、四氫呋喃或二噁咁中的氫氧化鈉、氫氧化鉀或氫氧化鋰水溶液，在室溫下或直至回流條件下）將其中R₁、R₉、R₇、R₈和A係如式I中所定義的並且其中R₀₀係C₁-C₆烷基式 (XXIV) 之化合物皂化。

【0139】 其中R₁、R₉、R₇、R₈和A係如式I中所定義的並且其中R₀₀係C₁-C₆烷基的式 (XXIV) 之化合物可以藉由以下方式來製備：在上面已描述的條件（參見流程5，將化合物III轉化為II）下使其中R₉、R₁和A係如式I中所定義的並且其中R₀₀係C₁-C₆烷基）的式 (XXV-b) 之化合物與其中R₇和R₈係如式I中所定義的並且其中Xa係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是碘或溴），或芳基-、烷基-或鹵代烷基磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式IV的化合物反應。

【0140】 其中R₉、R₁和A係如式I中所定義的並且其中R₀₀係C₁-C₆烷基的式 (XXV-b) 之化合物可以藉由以下方式來製備：在上面已描述的條件（參見流程6，將化合物V轉化為III）下使其中R₁、R₉和A係如式I中所定義的並且其中R₀₀係C₁-C₆烷基的式 (XXV-a) 之化合物與其中Xa係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是氯或溴），或芳基-、烷基-或鹵代烷基磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式VI的化合物反應。

【0141】 可替代地，其中R₁、R₉、R₇、R₈和A係如式I中所定義的並且其中

R_{00} 係 C_1 - C_6 烷基的式 (XXIV) 之化合物可以藉由以下方式來製備：使其中 R_1 、 R_9 、 R_7 、 R_8 和A係如式I中所定義的並且其中 R_{00} 係 C_1 - C_6 烷基的式 (XXV-c) 之化合物經受上面已描述的脫水條件（參見流程7，將化合物VII轉化為II）。

【0142】 其中 R_1 、 R_9 、 R_7 、 R_8 和A係如式I中所定義的並且其中 R_{00} 係 C_1 - C_6 烷基的式 (XXV-c) 之化合物可以藉由以下方式來製備：在上面描述的條件下（參見流程8，將化合物V轉化為VII），使其中 R_1 、 R_9 和A係如式I中所定義的並且其中 R_{00} 係 C_1 - C_6 烷基的式 (XXV-a) 之化合物與其中 R_7 和 R_8 係如式I中所定義的並且其中Xa係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是溴），或芳基-、烷基-或鹵代烷基磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式VIII的化合物反應。

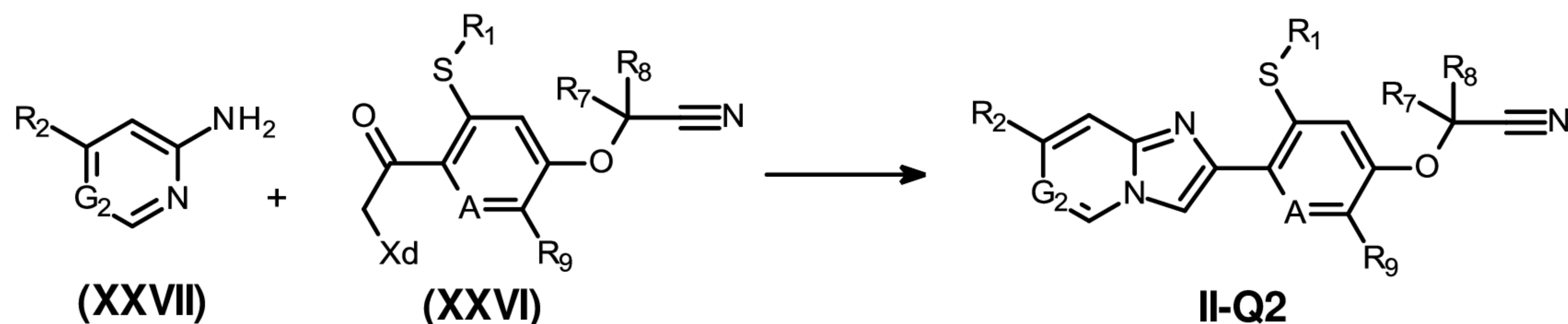
【0143】 其中 R_1 、 R_9 和A係如式I中所定義的並且其中 R_{00} 係 C_1 - C_6 烷基的式 (XXV-a) 之化合物可以藉由以下方式來製備：上面已描述的條件（參見流程9，將化合物IX轉化為V）下，使其中 R_1 、 R_9 和A係如式I中所定義的並且其中 R_{00} 係 C_1 - C_6 烷基並且其中Xc係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是溴），或芳基-、烷基-或鹵代烷基-磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式 (XXV) 之化合物與例如苯甲醛肟 $PhC=NOH$ （較佳的是(E)-苯甲醛肟）反應。可替代地，由式 (XXV) 之化合物製備式 (XXV-a) 之化合物的方法也可以涉及在流程9中也已經描述的硼基化/氧化條件。

【0144】 其中 R_1 、 R_9 和A係如式I中所定義的並且其中 R_{00} 係 C_1 - C_6 烷基並且其中Xc係脫離基（例如像氯、溴或碘，或芳基-、烷基-或鹵代烷基磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式 (XXV) 之化合物，特別是其中Xc係鹵素（甚至更較佳的是氯、溴或碘）的那些化合物，或者是已知化合物，可商購獲得，或者可以藉由文獻中（如例如在WO 2016/005263、WO 2016/023954、WO 2016/026848和WO 2016/104746中）描述的已知方法來製備。

【0145】 可替代地，其中Q為 Q_2 的式II的化合物（定義式II- Q_2 的化合物），

其中 R_1 、 R_9 、 R_7 、 R_8 、 A 、 G_2 和 R_2 係如式I中所定義的，

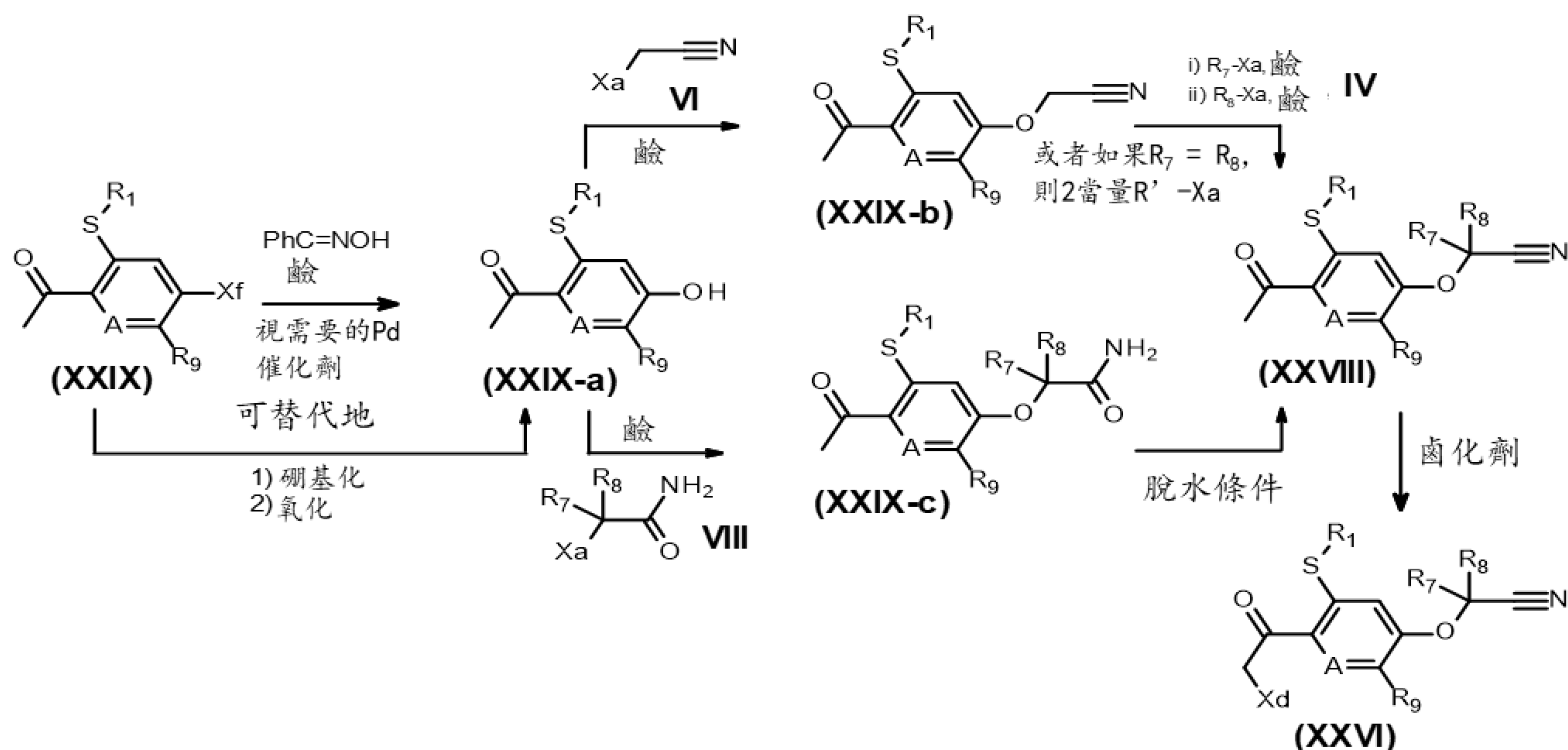
流程13：



可以藉由以下方式來製備（流程13）：在例如乙醇或乙腈的惰性溶劑中，視需要在諸如碳酸鈉、碳酸鉀或碳酸銻、或氧化鎂的合適鹼的存在下在 50°C 與 150°C 之間的溫度下，視需要在微波加熱條件下，其中 R_1 、 R_9 、 R_7 、 R_8 和 A 係如式I中所定義的並且其中 X_d 係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是氯或溴））的式(XXVI)之化合物與其中 G_2 和 R_2 係如式I中所定義的式(XXVII)化合物縮合。此類方法先前已經描述於例如WO 2012/49280或WO 2003/031587中。其中 G_2 和 R_2 係如式I中所定義的式(XXVII)之化合物或者是已知化合物，可商購獲得，或者可藉由熟悉該項技術者已知的已知方法製備，特別參見WO 2016/071214。

【0146】 其中 R_1 、 R_9 、 R_7 、 R_8 和 A 係如式I中所定義的並且其中 X_d 係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是氯或溴））的式(XXVI)之化合物

流程14：



可以藉由以下方式來製備（流程14）：典型地在諸如甲醇、乙腈、四氫呋喃、乙酸乙酯、氯仿或二氯甲烷、或其混合物的溶劑中在0°C與150°C之間、較佳的是在室溫與120°C之間的溫度下，視需要在微波加熱條件下，用鹵化試劑（「Xd⁺」源）（例如N-溴琥珀醯亞胺、N-碘琥珀醯亞胺、N-氯琥珀醯亞胺、I₂、CuBr₂、在乙酸中的Br₂、或三甲基(苯基)三溴化銨PhNMe₃⁺Br₃⁻）處理其中R₁、R₉、R₇、R₈和A係如式I中所定義的式 (XXVIII) 之化合物。此類方法先前已經描述於例如WO 2016/071214中。

【0147】 其中R₁、R₉、R₇、R₈和A係如式I中所定義的式 (XXVIII) 之化合物可以藉由以下方式來製備：在上面已描述的條件（參見流程5，將化合物III轉化為II）下，使其中R₉、R₁和A係如式I中所定義的式 (XXIX-b) 之化合物與其中R₇和R₈係如式I中所定義的並且其中Xa係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是碘或溴），或芳基-、烷基-或鹵代烷基磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式IV的化合物反應。

【0148】 其中R₉、R₁和A係如式I中所定義的式 (XXIX-b) 之化合物可以藉由以下方式來製備：在上面已描述的條件（參見流程6，將化合物V轉化為III）下，使其中R₁、R₉和A係如式I中所定義的式 (XXIX-a) 之化合物與其中Xa係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是氯或溴），或芳基-、烷基-或鹵代烷基磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式VI的化合物反應。

【0149】 可替代地，其中R₁、R₉、R₇、R₈和A係如式I中所定義的式 (XXVIII) 之化合物可以藉由以下方式來製備：使其中R₁、R₉、R₇、R₈和A係如式I中所定義的式 (XXIX-c) 之化合物經受上面已描述的脫水條件（參見流程7，將化合物VII轉化為II）。

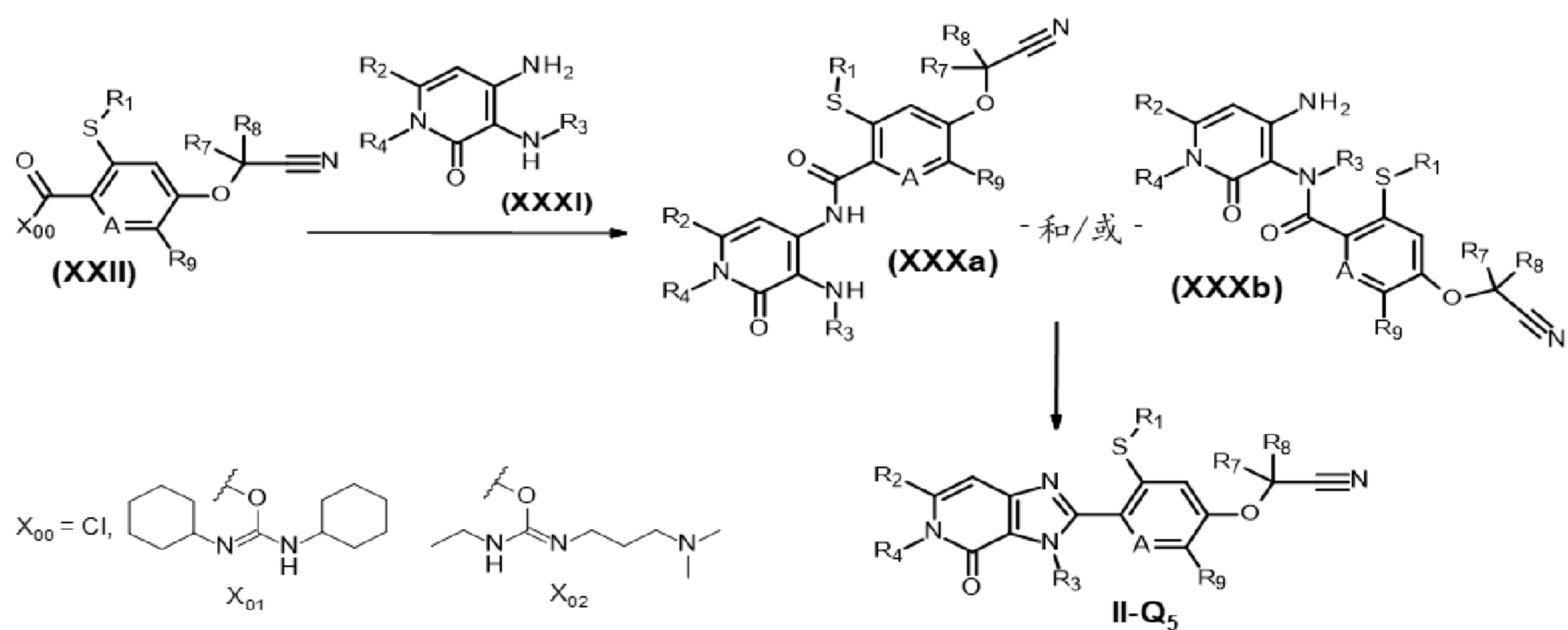
【0150】 其中R₁、R₉、R₇、R₈和A係如式I中所定義的式 (XXIX-c) 之化合物可以藉由以下方式來製備：在上面已描述的條件（參見流程8，將化合物V轉

化為VII) 下，使其中 R_1 、 R_9 和A係如式I中所定義的式 (XXIX-a) 之化合物與其中 R_7 和 R_8 係如式I中所定義的並且其中Xa係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是溴），或芳基-、烷基-或鹵代烷基磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式VIII的化合物反應。

【0151】 其中 R_1 、 R_9 和A係如式I中所定義的式 (XXIX-a) 之化合物可以藉由以下方式來製備：在上面已描述的條件（參見流程9，將化合物IX轉化為V）下，使其中 R_1 、 R_9 和A係如式I中所定義的並且其中Xf係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是溴），或芳基-、烷基-或鹵代烷基-磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式 (XXIX) 之化合物與例如苯甲醛肟 $\text{PhC}=\text{NOH}$ 、較佳的是(E)-苯甲醛肟反應。可替代地，由式 (XXIX) 之化合物製備式 (XXIX-a) 之化合物的方法也可以涉及在流程9中也已經描述的硼基化/氧化條件。

【0152】 其中 R_1 、 R_9 和A係如式I中所定義的並且其中Xf係脫離基（例如像氯、溴或碘，或芳基-、烷基-或鹵代烷基磺酸酯（諸如三氟甲磺酸酯））的式 (XXIX) 之化合物，特別是其中Xf係鹵素（甚至更較佳的是氯、溴或碘；特別較佳的是氯或溴）的那些化合物，或者是已知化合物，可商購獲得，或者可以藉由文獻中（如例如在WO 2016/071214中）描述的已知方法來製備。

【0153】 可替代地，其中Q為 Q_5 的式II的化合物（定義式II- Q_5 的化合物），其中 R_1 、 R_9 、 R_7 、 R_8 、A、 R_3 、 R_4 和 R_2 係如式I中所定義的，
流程15：



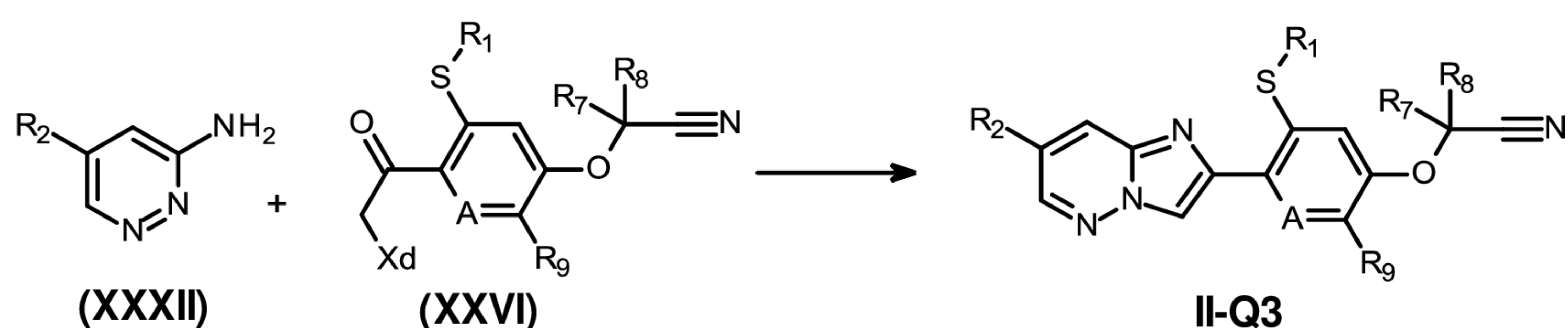
可以藉由以下方式來製備（流程15）：在上面已描述的條件（參見流程11，將化合物(XX)轉化為II-Q1）下，將其中 R_1 、 R_9 、 R_7 、 R_8 、 A 、 R_3 、 R_4 和 R_2 係如式I中所定義的式(XXXa)之化合物或具有相同的取代基定義的式(XXXb)之區域異構物或其任何比率的混合物環化。

【0154】 其中 R_1 、 R_9 、 R_7 、 R_8 、 A 、 R_3 、 R_4 和 R_2 係如式I中所定義的式(XXXa)之化合物或具有相同取代基定義的式(XXXb)之區域異構物或其任何比率的混合物可以藉由以下方式來製備：在上面已經描述的條件（參見流程11，將化合物(XXII)和(XI)轉化為化合物(XX)）下，用其中 R_3 、 R_4 和 R_2 係如式I中所定義的式(XXXI)之化合物處理上述活性物質(XXII)。

【0155】 其中 R_3 、 R_4 和 R_2 係如式I中所定義的式(XXXI)之化合物先前已在例如WO 2016/023954、WO 2016/142326和WO 2017/133994中描述。

【0156】 可替代地其中Q為 Q_3 的式II的化合物（定義式II- Q_3 的化合物），其中 R_1 、 R_9 、 R_7 、 R_8 、 A 和 R_2 係如式I中所定義的，

流程16：

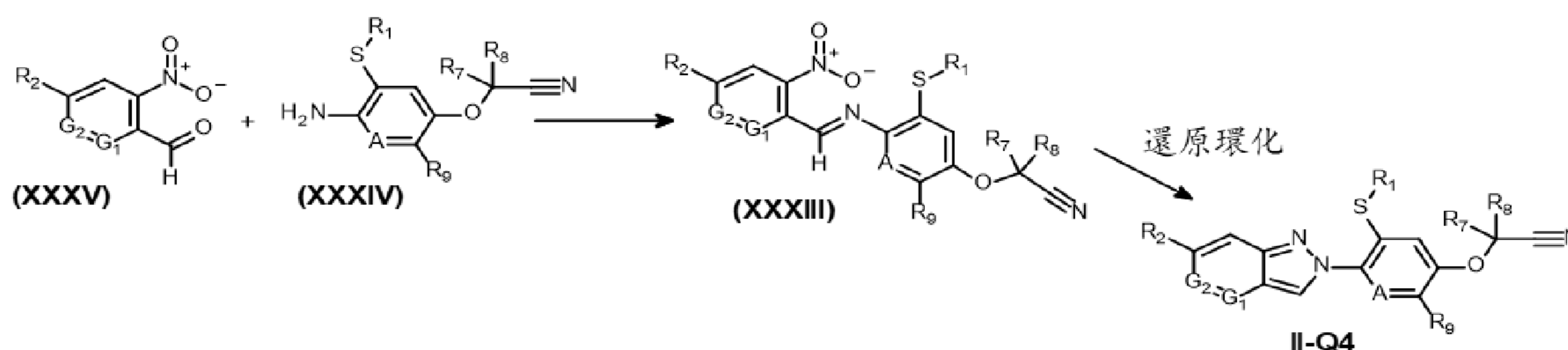


可以藉由以下方式製備（流程16）：在例如乙醇、甲苯或乙腈的惰性溶劑中，

視需要在諸如碳酸鈉、碳酸鉀或碳酸銻（或碳酸氫鈉或碳酸氫鉀）的合適鹼的存在下在50°C與150°C之間的溫度下，視需要在微波加熱條件下，使其中R₁、R₉、R₇、R₈和A係如式I中所定義的並且其中Xd係脫離基（例如像氯、溴或碘（較佳的是氯或溴））的上述式 (XXVI) 之化合物與其中R₂係如式I中所定義的式 (XXXII) 之化合物縮合。此類方法先前已經描述於例如WO 2011/074658中。其中R₂係如式I中所定義的式 (XXXII) 之化合物或者是已知化合物，可商購獲得，或者可藉由熟悉該項技術者已知的已知方法來製備（參見例如WO 2011/074658和WO 2010/083145）。

【0157】 可替代地，其中Q為Q₄的式II的化合物（定義式II-Q₄的化合物），其中R₁、R₉、R₇、R₈、A、G₁、G₂和R₂如式I中所定義的，

流程17：



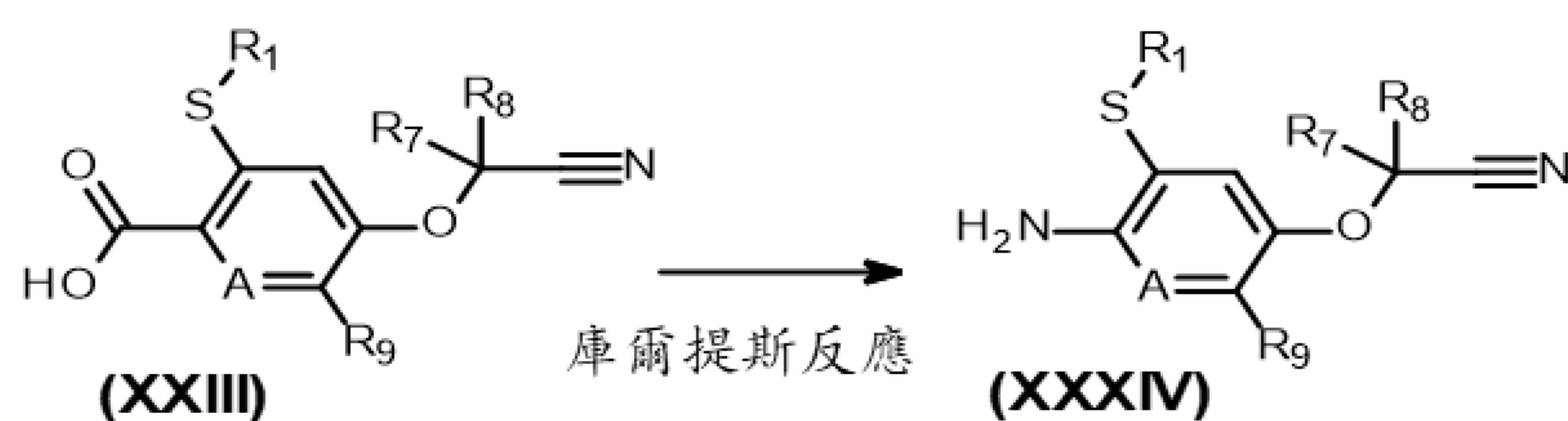
可以藉由以下方式來製備（流程17）：在諸如亞磷酸三烷基酯（更具體地，例如，亞磷酸三乙酯）、三烷基膦或三苯基膦的還原劑的存在下，還原環化其中R₁、R₉、R₇、R₈、A、G₁、G₂和R₂係如式I中所定義的式 (XXXIII) 之化合物。此還原環化的原理類似於已知的卡多根（Cadogan）反應。可替代地，此反應可以在金屬催化劑的存在下進行，該金屬催化劑例如鉬(VI)催化劑（諸如MoO₂Cl₂(dmf)₂ [氯化氧鉬-雙(二甲基甲醯胺)]，或更通常地用與諸如亞磷酸三乙酯、三苯基膦或CO的還原劑組合的過渡金屬錯合物。合適的溶劑可以包括在室溫與200°C之間、較佳的是在50°C與160°C之間的溫度下，視需要在微波加熱條件下，使用過量的還原劑（諸如亞磷酸三乙酯），或例如甲苯或二甲苯。此類還原環化反應條件描述於例如WO 2017/134066中。

【0158】 其中 R_1 、 R_9 、 R_7 、 R_8 、 A 、 G_1 、 G_2 和 R_2 係如式I中所定義的式 (XXXIII) 之化合物可以藉由以下方式來製備：通常在室溫與 200°C 之間、較佳的是在 40°C 與 160 之間的溫度下加熱，視需要在微波加熱條件下，在合適的溶劑中使其中 R_1 、 R_9 、 R_7 、 R_8 和 A 係如式I中所定義的式 (XXXIV) 之化合物與其中 G_1 、 G_2 和 R_2 係如式I中所定義的式 (XXXV) 之化合物之間進行反應，該合適的溶劑可以包括例如甲苯或二甲苯 $^\circ\text{C}$ 。式 (XXXIII) 之化合物的形成可需要藉由共沸蒸餾或借助例如像 TiCl_4 或分子篩的乾燥劑來除去水。式 (XXXIII) 之席夫鹼的這種形成係熟悉該項技術者已知的，並且描述於例如WO 2017/134066中。

【0159】 其中 G_1 、 G_2 和 R_2 係如式I中所定義的式 (XXXV) 之化合物或者是已知化合物，可商購獲得，或者可以藉由熟悉該項技術者已知的已知方法來製備。

【0160】 其中 R_1 、 R_9 、 R_7 、 R_8 和 A 係如式I中所定義的式 (XXXIV) 之化合物

流程18：

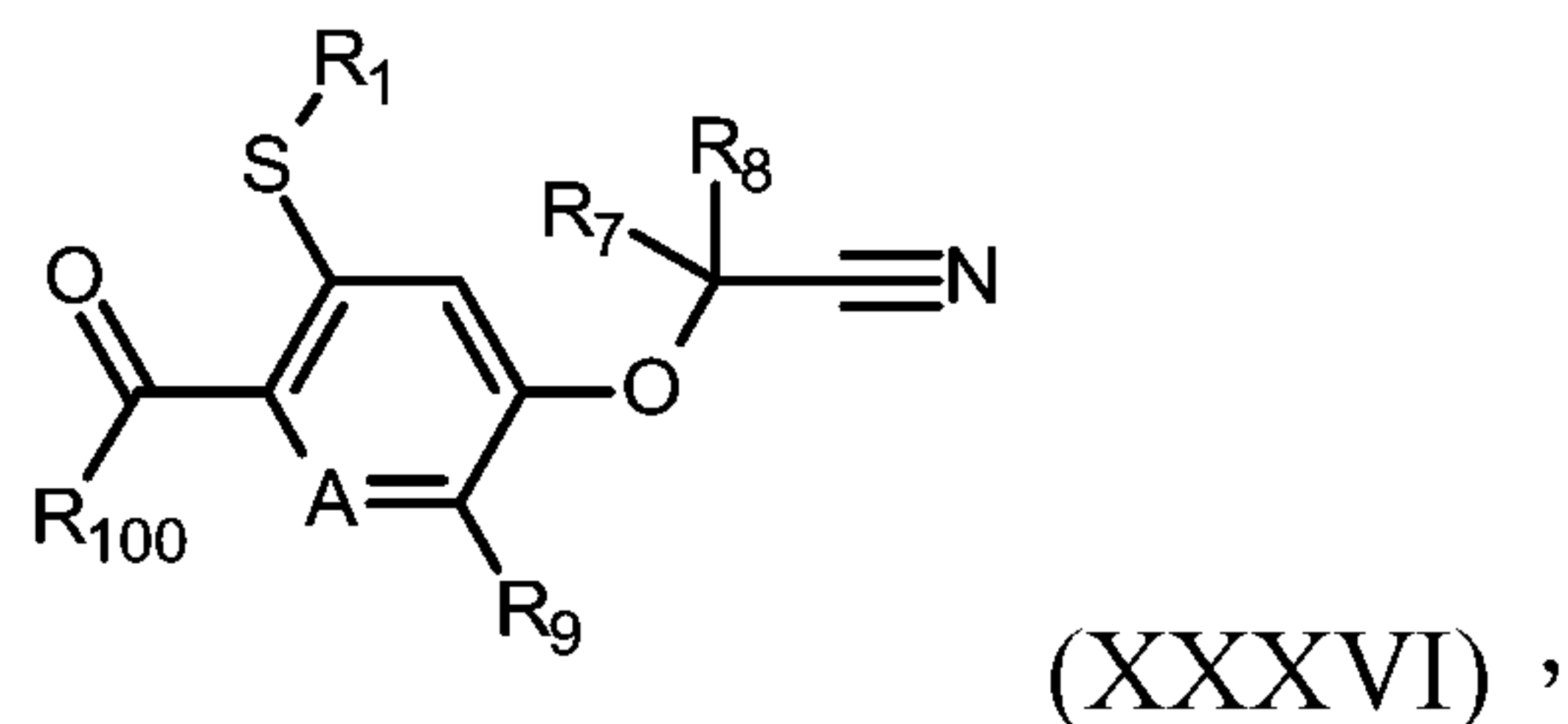


可以藉由以下方式來製備（流程18）：使上述式 (XXIII) 之化合物（或也上述的其相應的活化物質 (XXII)）經受熟悉該項技術者已知的庫爾提斯（Curtius）重排/降解條件。例如，在WO 2009099086和Journal of Medicinal Chemistry [藥物化學雜誌], 55(22), 9589-9606; 2012中已經描述了此類條件。

【0161】 反應物可以在鹼的存在下反應。合適的鹼的實例係鹼金屬或鹼土金屬氫氧化物、鹼金屬或鹼土金屬氫化物、鹼金屬或鹼土金屬醯胺、鹼金屬或鹼土金屬醇鹽、鹼金屬或鹼土金屬乙酸鹽、鹼金屬或鹼土金屬碳酸鹽、鹼金屬或鹼土金屬二烷基醯胺或者鹼金屬或鹼土金屬烷基矽基醯胺、烷基胺、伸烷基

二胺、游離的或N-烷基化的飽和或不飽和的環烷基胺、鹼性雜環、氫氧化銨以及碳環胺。可提及的實例係氫氧化鈉、氫化鈉、胺基鈉、甲醇鈉、乙酸鈉、碳酸鈉、三級丁醇鉀、氫氧化鉀、碳酸鉀、氫化鉀、二異丙基胺基鋰、雙(三甲基矽基)胺基鉀、氫化鈣、三乙胺、二異丙基乙胺、三伸乙基二胺、環己胺、N-環己基-N,N-二甲基胺、N,N-二乙基苯胺、吡啶、4-(N,N-二甲基胺基)吡啶、吡啶、N-甲基咪啉、苄基三甲基氫氧化銨和1,8-二氮雜二環[5.4.0]十一碳-7-烯(DBU)。

【0162】 式XXXVI的化合物



其中

R₁、R₇、R₈、R₉和A係如上式I所定義的並且R₁₀₀係OH、氯或C₁-C₄烷氧基，

【0163】 係新穎的，係為了製備根據本發明的式I的化合物而特別研發的並且因此表示本發明的另一目的。式I的化合物的取代基的較佳的項和較佳的實施方式對於式XXXVI的化合物也是有效的。

【0164】 反應物可以本身相互反應，即不添加溶劑或稀釋劑。然而，在大多數情況下，添加惰性溶劑或稀釋劑或該等物質的混合物係有利的。如果反應在鹼的存在下進行，則過量使用的鹼，諸如三乙胺、吡啶、N-甲基咪啉或N,N-二乙基苯胺，也還以充當溶劑或稀釋劑。

【0165】 該反應有利地在從大約-80°C至大約+140°C、較佳的是從大約-30°C至大約+100°C的溫度範圍內，在許多情況下在環境溫度與大約+80°C之間的範圍內進行。

【0166】 式I的化合物可以本身已知的方式轉化為另一種式I的化合物，這係藉由以慣用的方式將式I的起始化合物的一個或多個取代基用根據本發明的另

一個或其他一個或多個取代基替代來實現的。

【0167】 取決於所選的適合各自情況的反應條件以及起始材料，有可能例如，在一個反應步驟中僅將一個取代基用根據本發明的另一個取代基替代，或者在同一個反應步驟中可以將多個取代基用多個根據本發明的其他取代基來替代。

【0168】 式I的化合物的鹽可以本身已知的方式來製備。因此，例如，式I的化合物的酸加成鹽係藉由用合適的酸或合適的離子交換劑試劑進行處理來獲得的，並且與鹼的鹽係藉由用合適的鹼或用合適的離子交換劑試劑進行處理來獲得的。

【0169】 可以慣用的方式將式I的化合物的鹽轉化為游離的化合物I、酸加成鹽（例如藉由用合適的鹼性化合物或用合適的離子交換劑試劑進行處理）以及與鹼的鹽（例如藉由用合適的酸或用合適的離子交換劑試劑進行處理）。

【0170】 可以本身已知的方式將式I的化合物的鹽轉化為式I的化合物的其他鹽、酸加成鹽，例如轉化成其他酸加成鹽，例如藉由在合適的溶劑中用酸的合適的金屬鹽（諸如鈉、鋇或銀的鹽，例如用乙酸銀）處理無機酸的鹽（諸如鹽酸鹽），在該溶劑中，所形成的無機鹽（例如氯化銀）係不溶的並且因此從該反應混合物中沈澱出。

【0171】 取決於程序或反應條件，具有成鹽特性的式I的化合物可以游離形式或鹽的形式獲得。

【0172】 取決於分子中存在的不對稱碳原子的數目、絕對和相對組態和/或取決於分子中存在的非芳香族雙鍵的組態，式I的化合物和適當時其互變異構物（在每種情況下呈游離形式或呈鹽形式）可以可能的異構物之一的形式或作為該等的混合物存在，例如以純異構物（諸如鏡像異構物和/或非鏡像異構物）的形式或作為異構物混合物，諸如鏡像異構物混合物（例如外消旋體、非鏡像

異構物混合物或外消旋體混合物)存在；本發明涉及純異構物以及還有所有可能的異構物混合物，並且在上文和下文中在每種情況下都應在這種意義上理解，即使當立體化學細節未在每種情況下明確提及時。

【0173】 可以將呈游離形式或呈鹽形式的式I的化合物的非鏡像異構物混合物或外消旋體混合物（它們的獲得可以取決於已選定的起始材料和程序）在該等組分的物理化學差異的基礎上，例如藉由分步結晶、蒸餾和/或層析法以已知的方式分離成純的非鏡像異構物或外消旋體。

【0174】 可以類似方式獲得的鏡像異構物混合物（諸如外消旋體）可以藉由已知方法拆分成光學鏡像物，例如藉由從光學活性溶劑中重結晶；藉由在手性吸附劑上的層析法，例如在乙醯纖維素上的高效液相層析法（HPLC）；借助於合適的微生物，藉由用特異性固定化酶裂解；藉由形成包含化合物，例如使用手性冠醚，其中僅一個鏡像異構物被錯合；或藉由轉化成非鏡像異構物的鹽，例如藉由使鹼性最終產物外消旋體與光學活性酸（諸如羧酸，例如樟腦酸、酒石酸或蘋果酸，或磺酸，例如樟腦磺酸）反應，並且例如基於其不同溶解度藉由分步結晶將可以這種方式獲得的非鏡像異構物混合物分離，以給出非鏡像異構物，可以藉由合適的試劑（例如鹼性試劑）的作用從該等非鏡像異構物中使所希望的鏡像異構物變成游離的。

【0175】 純的非鏡像異構物或鏡像異構物可以根據本發明來獲得，不僅是藉由分離合適的異構物混合物，而且還藉由通常已知的非鏡像立體選擇性或鏡像選擇性合成之方法，例如藉由用具有合適的立體化學的起始材料進行根據本發明的方法。

【0176】 可以藉由在酸酐（例如三氟乙酸酐）的存在下使式I的化合物與合適的氧化劑（例如 H_2O_2 /尿素加合物）反應來製備N-氧化物。此類氧化從文獻，例如從J. Med. Chem.[藥物化學雜誌] 32 (12), 2561-73, 1989或WO 00/15615已知。

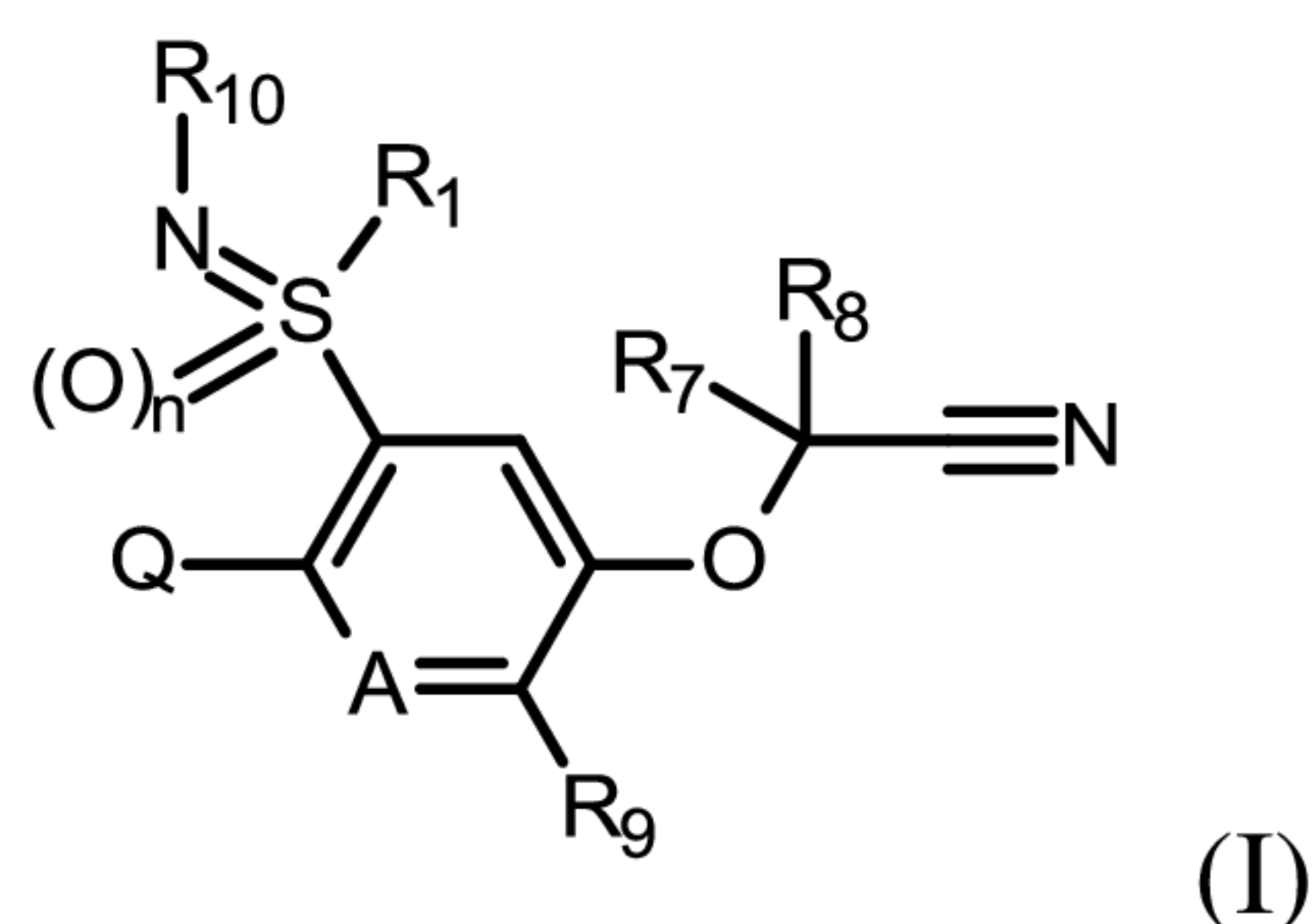
【0177】 其中R₂係C₁-C₄鹵代烷基亞磺醯基或C₁-C₄鹵代烷基磺醯基的化合物可藉由例如WO 19/008115中所描述的合適的氧化方法由其中R₂係C₁-C₄鹵代烷基氫硫基的相應化合物來製備。

【0178】 如果單個組分具有不同的生物活性，則有利的是在每種情況下分離或合成生物學上更有效的異構物，例如鏡像異構物或非鏡像異構物或異構物混合物，例如鏡像異構物混合物或非鏡像異構物混合物。

【0179】 式I的化合物和適當時其互變異構物（在每種情況下呈游離形式或呈鹽形式）如果適當的話還可以水合物的形式獲得和/或包括其他溶劑，例如可以用於使以固體形式存在的化合物結晶的那些。

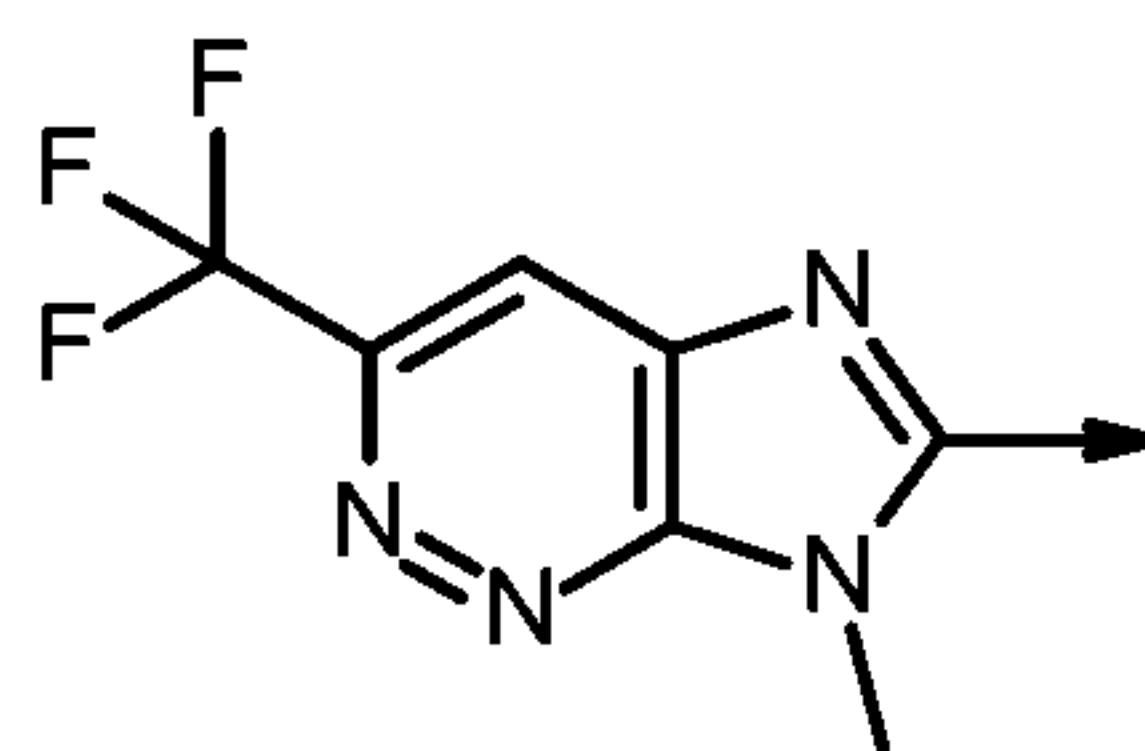
【0180】 可以根據上述方法製備根據下表X和A-1至A-17的式I的化合物。以下實例旨在說明本發明並且示出式I的較佳的化合物。

[表X]：式I的化合物中n、A、R₉、R₇和R₈的取代基定義：

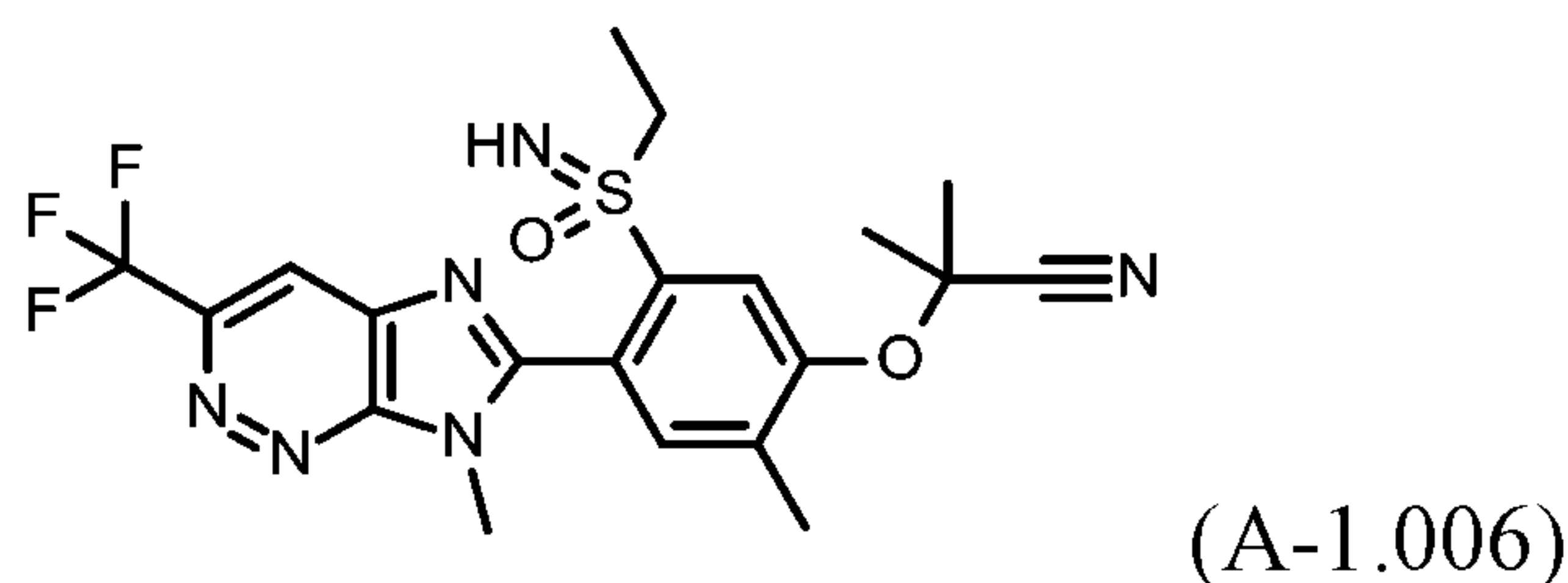


索引	n	A	R ₉	R ₇	R ₈
1	1	N	H	H	CH ₃
2	1	N	H	CH ₃	CH ₃
3	1	N	CH ₃	CH ₃	CH ₃
4	1	CH	H	H	CH ₃
5	1	CH	H	CH ₃	CH ₃
6	1	CH	CH ₃	CH ₃	CH ₃

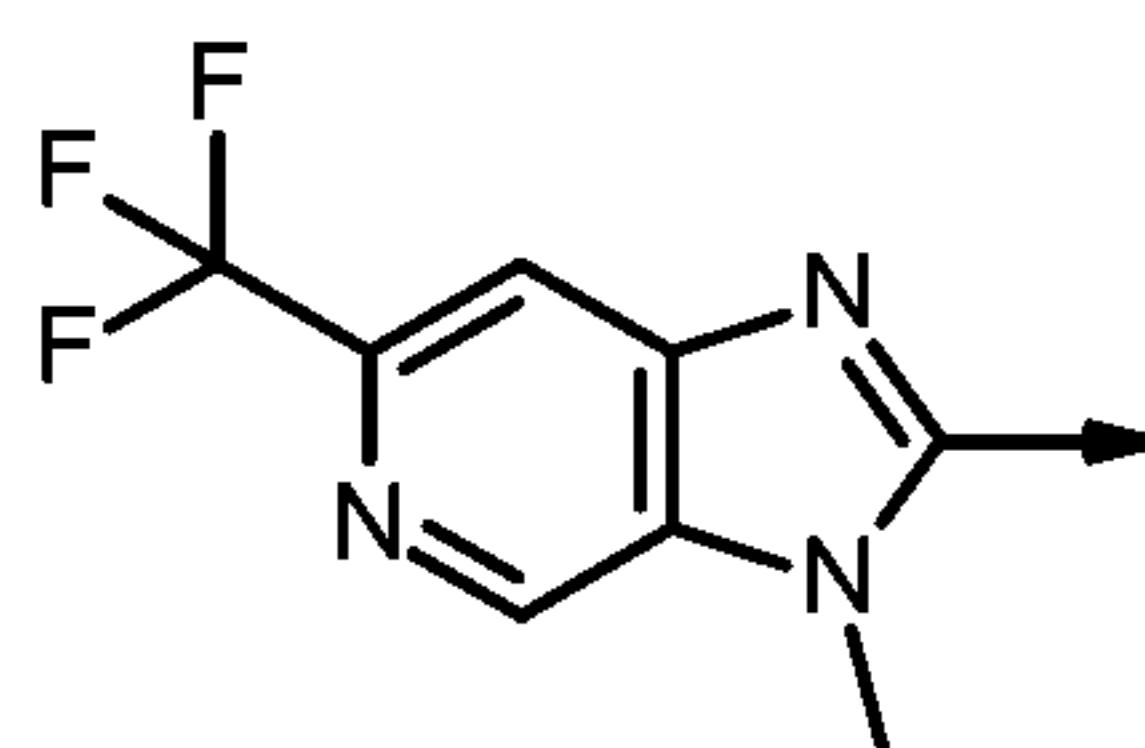
表A-1提供了6種式I的化合物A-1.001至A-1.006，其中R₁係乙基，R₁₀係氫，並且n、A、R₉、R₇和R₈係如在表X中所定義的，並且Q取自式Q₁的基團，為



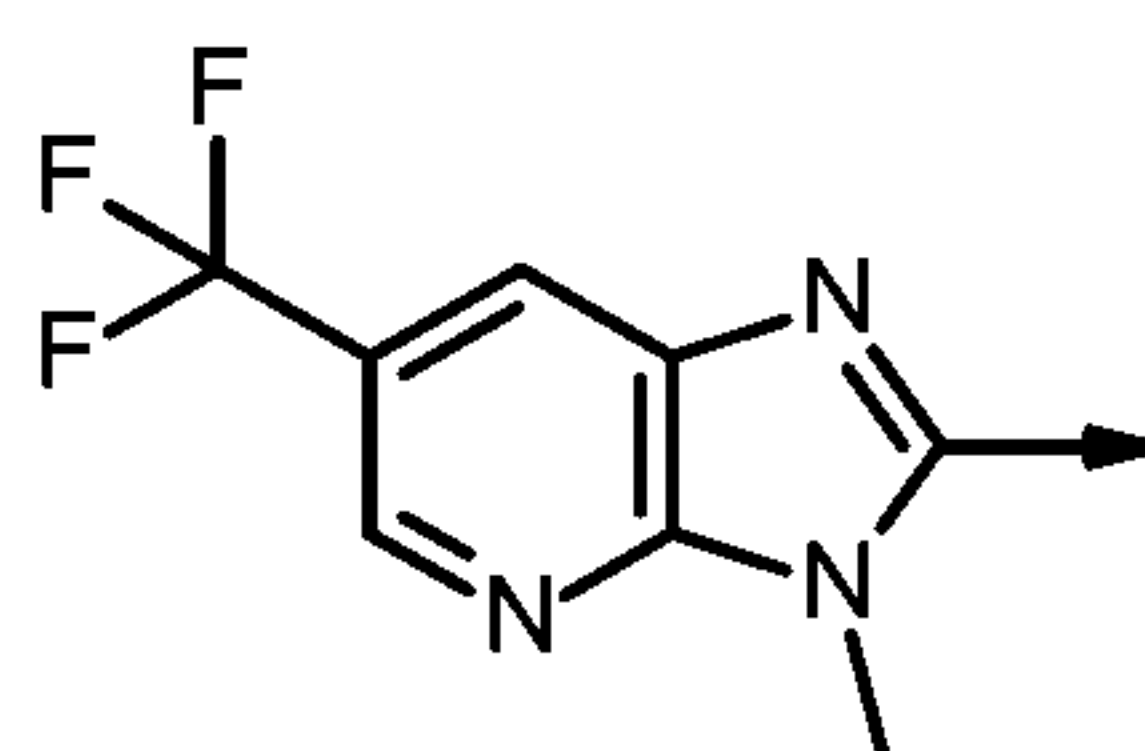
例如，化合物A-1.006具有以下結構：



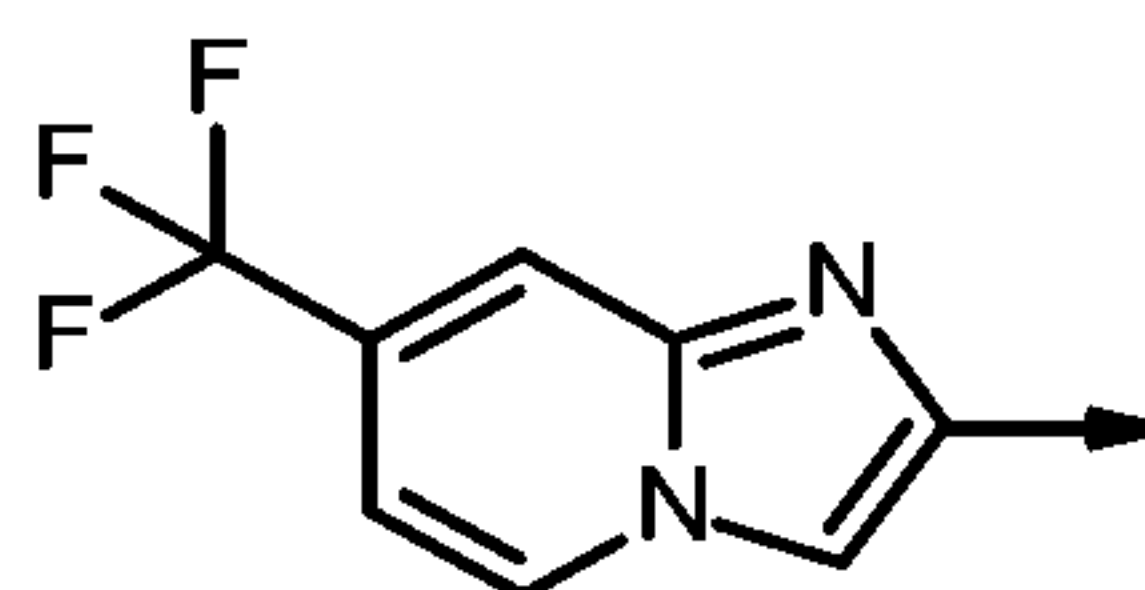
表A-2提供了6種式I的化合物A-2.001至A-2.006，其中R₁係乙基，R₁₀係氫，並且n、A、R₉、R₇和R₈係如在表X中所定義的，並且Q取自式Q₁的基團，為



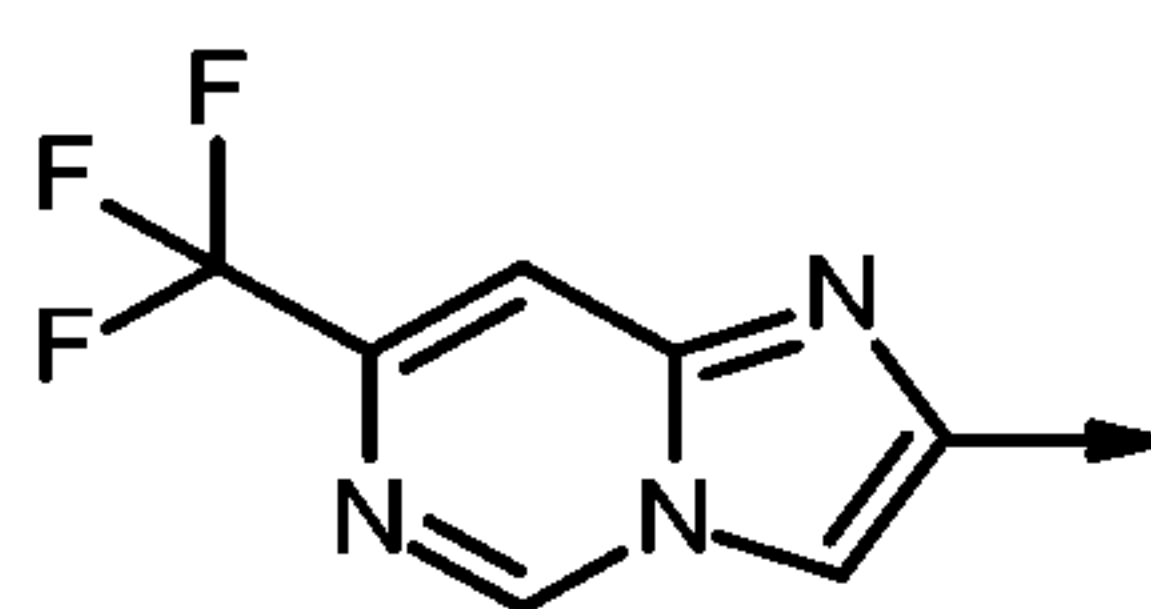
表A-3提供了6種式I的化合物A-3.001至A-3.006，其中R₁係乙基，R₁₀係氫，並且n、A、R₉、R₇和R₈係如在表X中所定義的，並且Q取自式Q₁的基團，為



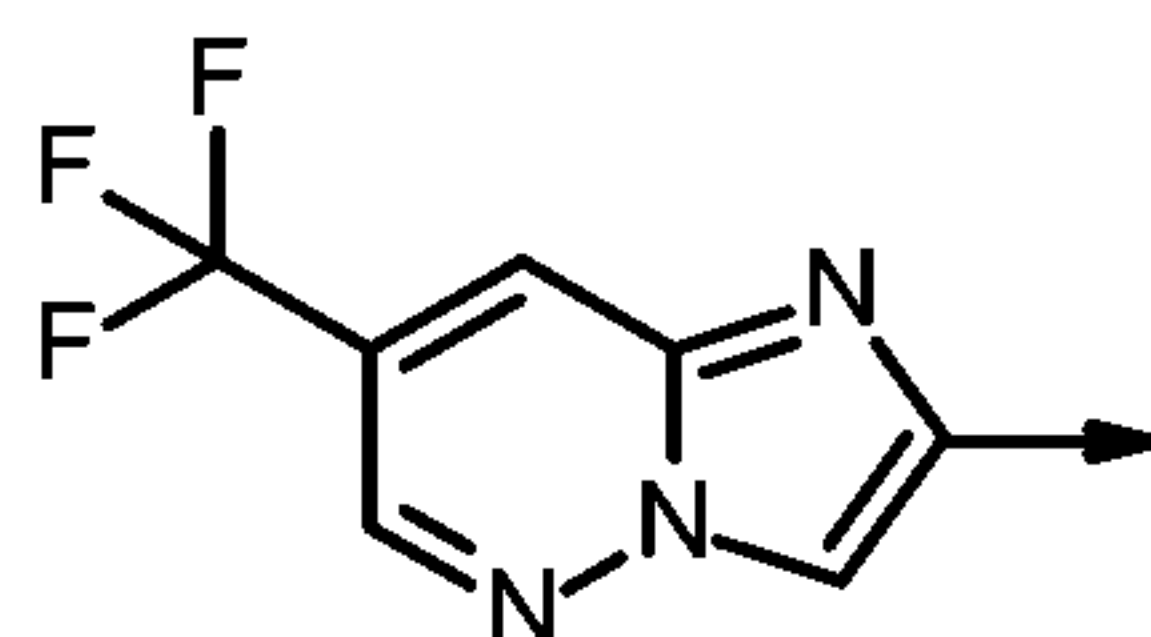
表A-4提供了6種式I的化合物A-4.001至A-4.006，其中R₁係乙基，R₁₀係氫，並且n、A、R₉、R₇和R₈係如在表X中所定義的，並且Q取自式Q₂的基團，為



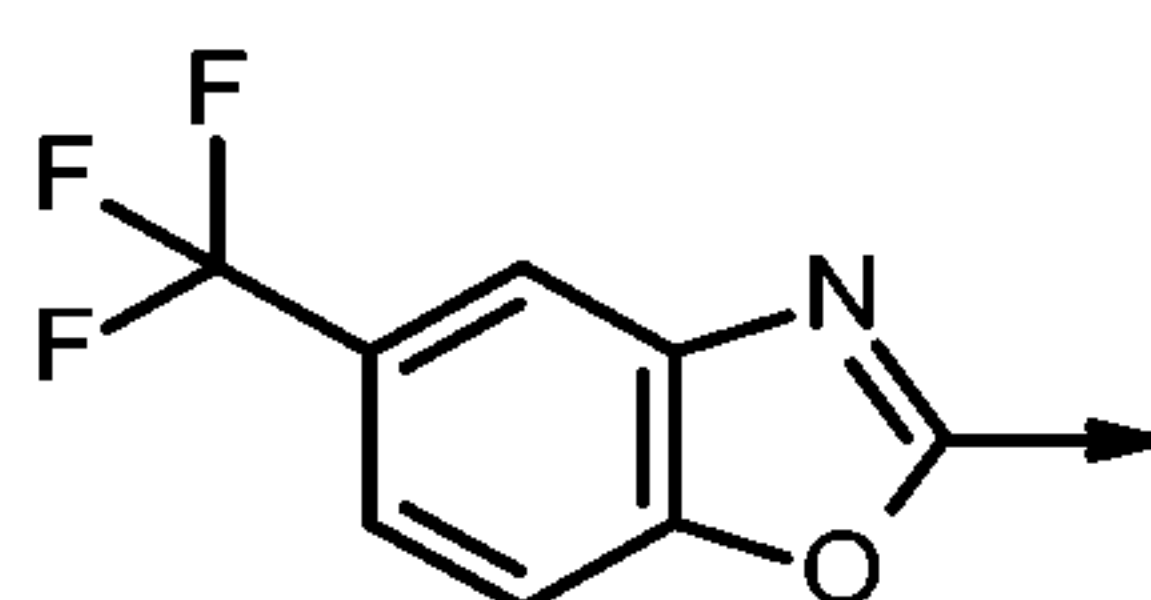
表A-5提供了6種式I的化合物A-5.001至A-5.006，其中R₁係乙基，R₁₀係氫，並且n、A、R₉、R₇和R₈係如在表X中所定義的，並且Q取自式Q₂的基團，為



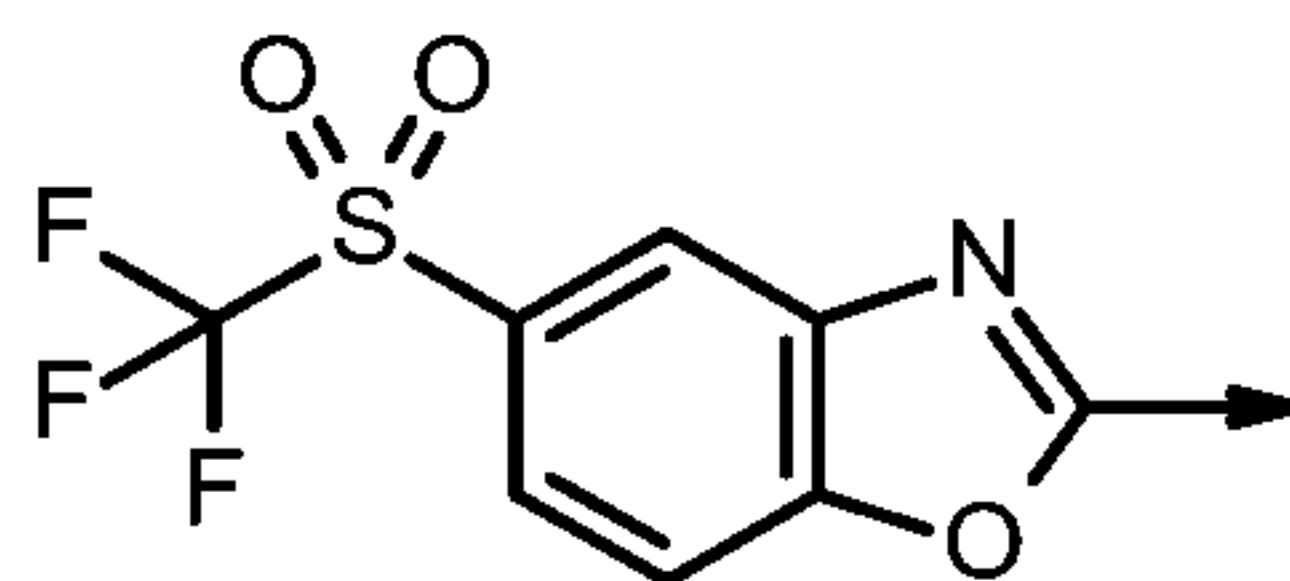
表A-6提供了6種式I的化合物A-6.001至A-6.006，其中R₁係乙基，R₁₀係氫，並且n、A、R₉、R₇和R₈係如在表X中所定義的，並且Q取自式Q₃的基團，為



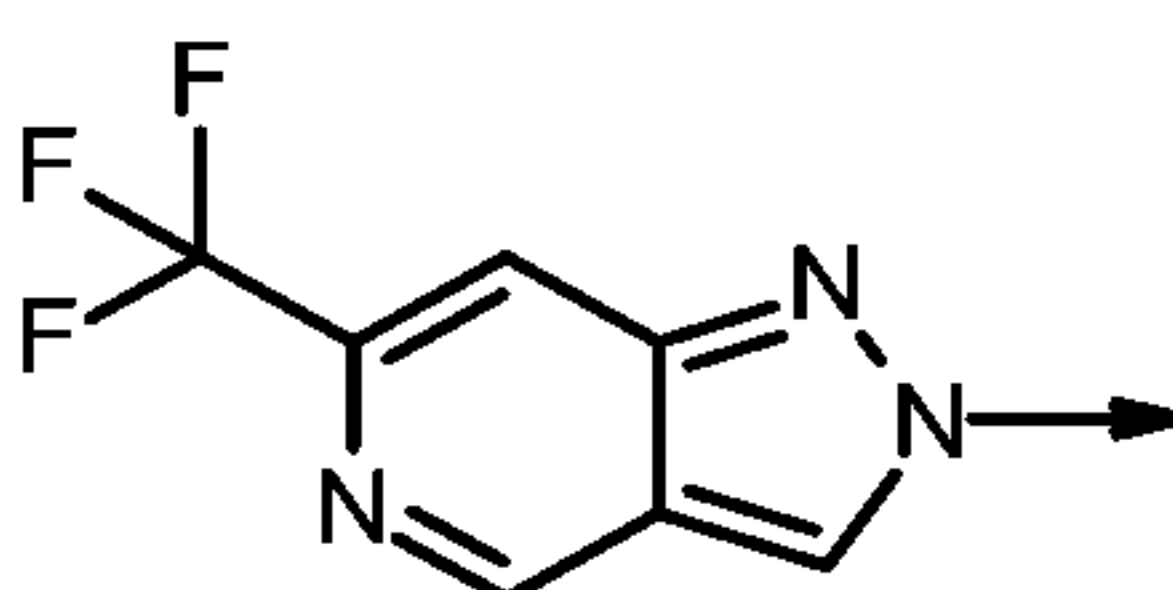
表A-7提供了6種式I的化合物A-7.001至A-7.006，其中R₁係乙基，R₁₀係氫，並且n、A、R₉、R₇和R₈係如在表X中所定義的，並且Q取自式Q₁的基團，為



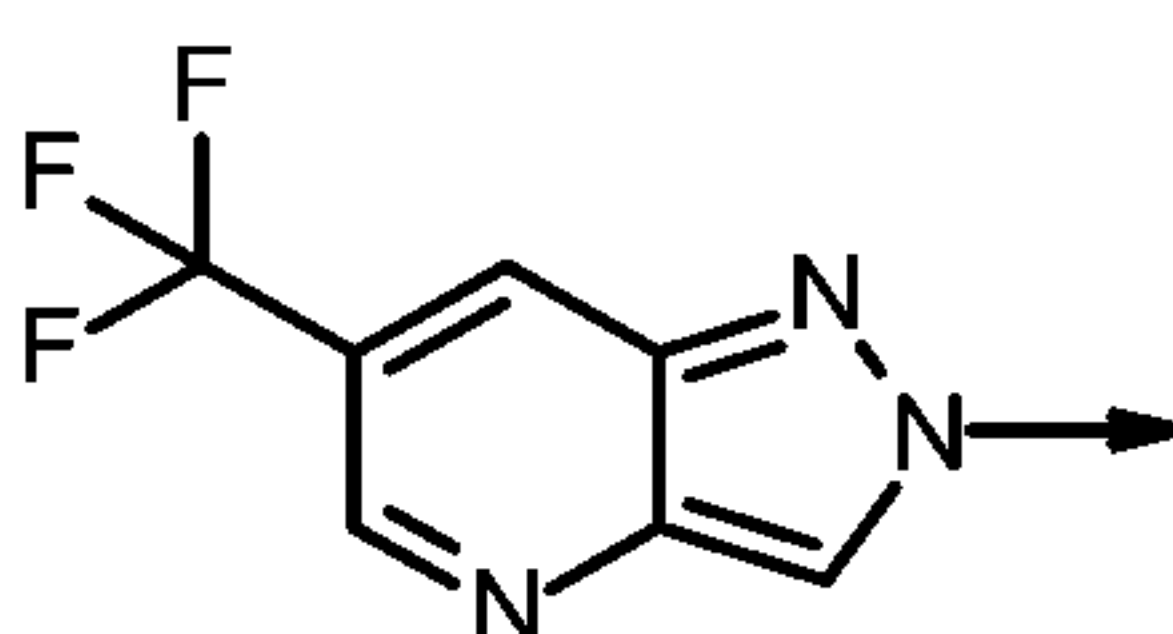
表A-8提供了6種式I的化合物A-8.001至A-8.006，其中R₁係乙基，R₁₀係氫，並且n、A、R₉、R₇和R₈係如在表X中所定義的，並且Q取自式Q₁的基團，為



表A-9提供了6種式I的化合物A-9.001至A-9.006，其中R₁係乙基，R₁₀係氫，並且n、A、R₉、R₇和R₈係如在表X中所定義的，並且Q取自式Q₄的基團，為

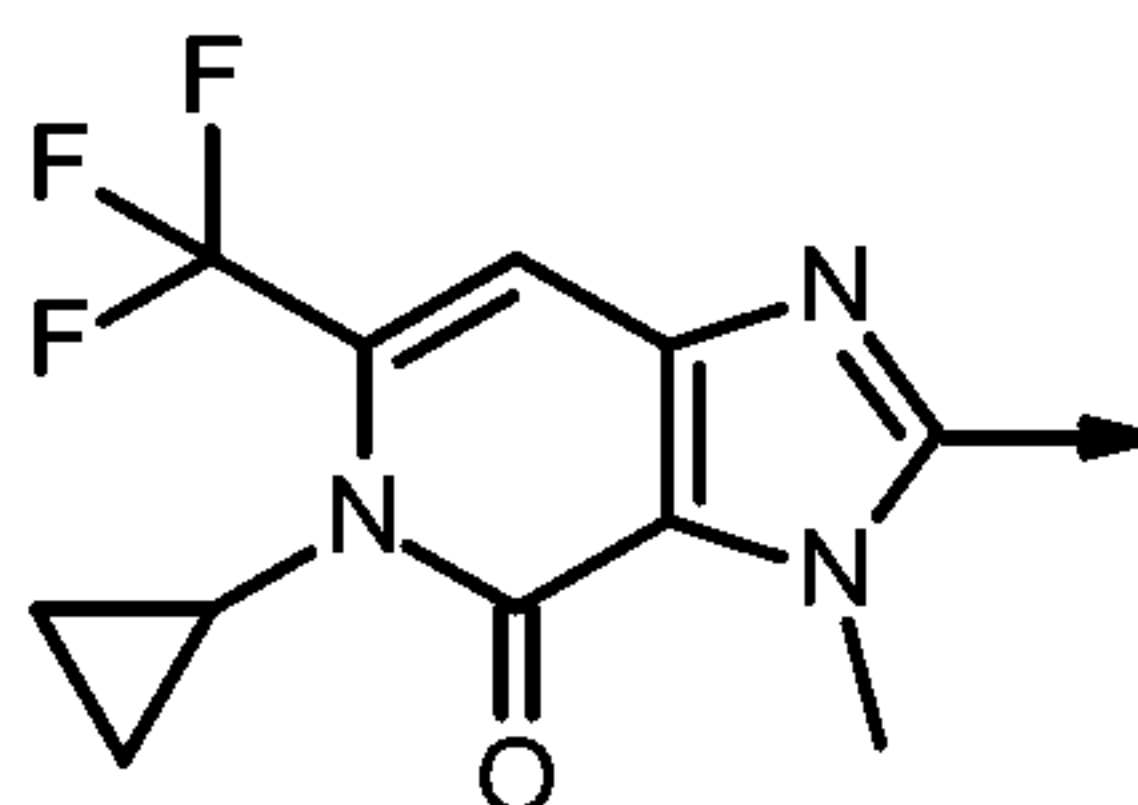


表A-10提供了6種式I的化合物A-10.001至A-10.006，其中R₁係乙基，R₁₀係氫，並且n、A、R₉、R₇和R₈係如在表X中所定義的，並且Q取自式Q₄的基團，為

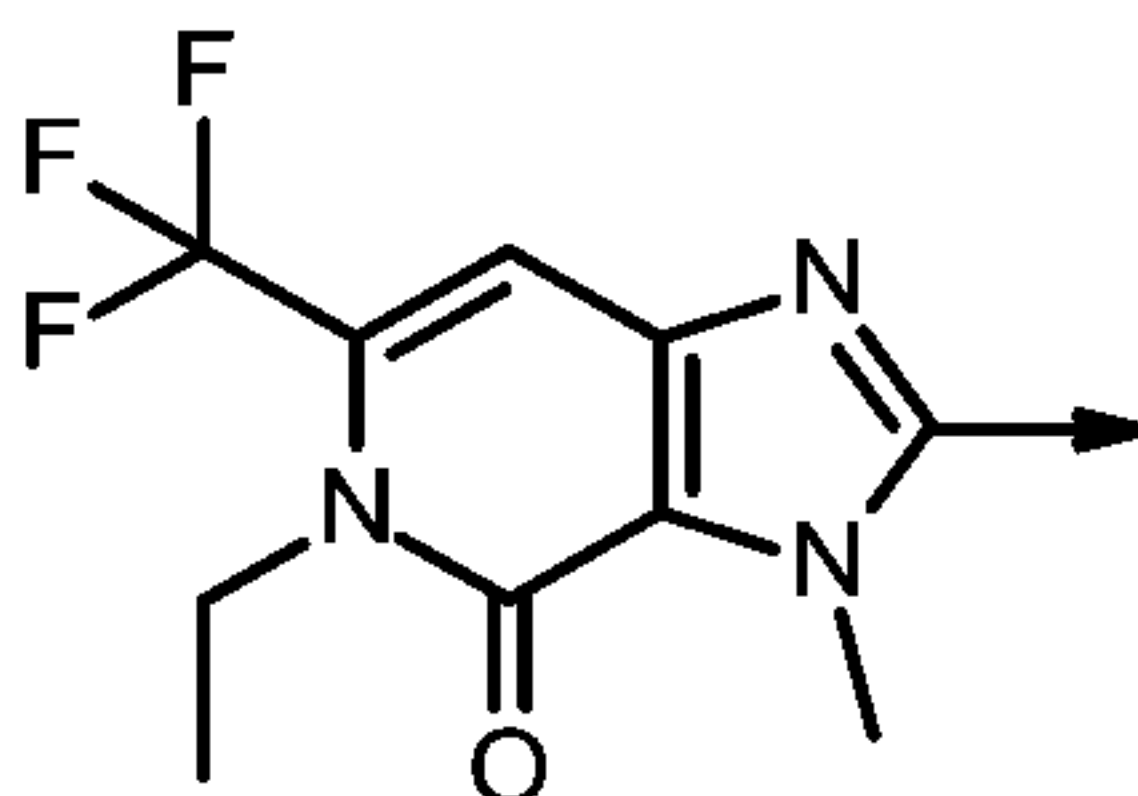


表A-11提供了6種式I的化合物A-11.001至A-11.006，其中R₁係乙基，R₁₀係

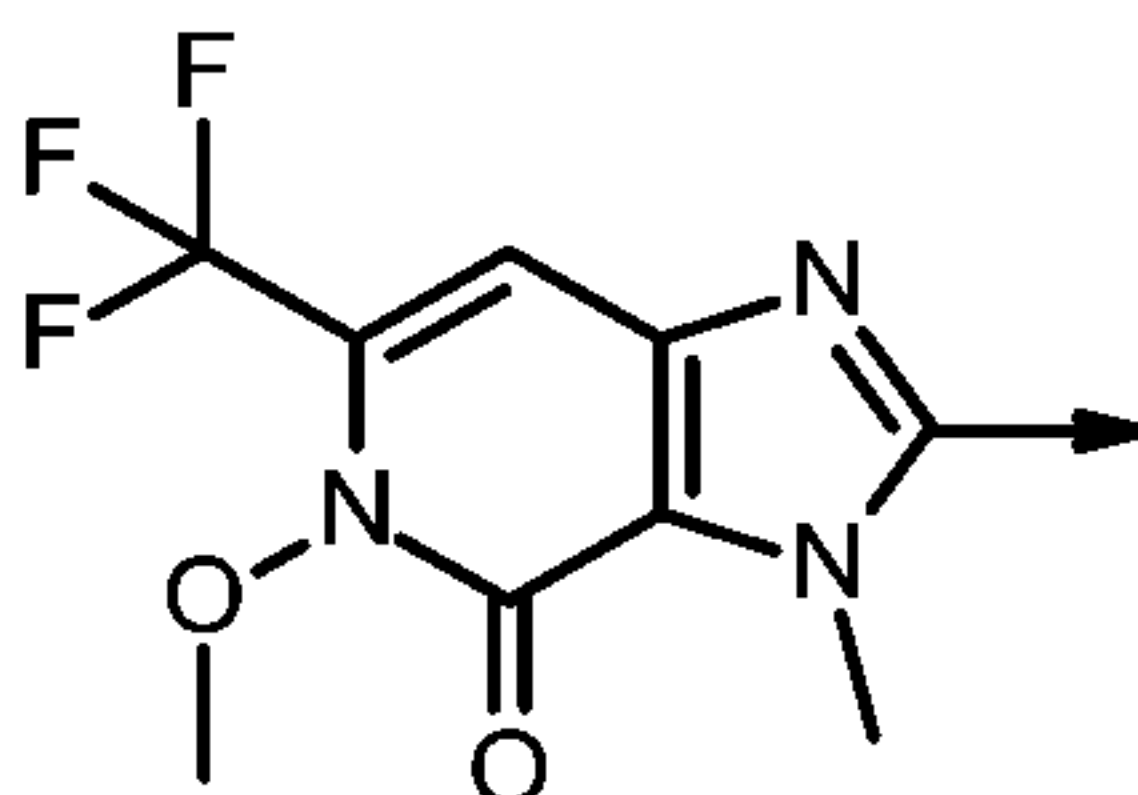
氫，並且n、A、R₉、R₇和R₈係如在表X中所定義的，並且Q取自式Q₅的基團，為



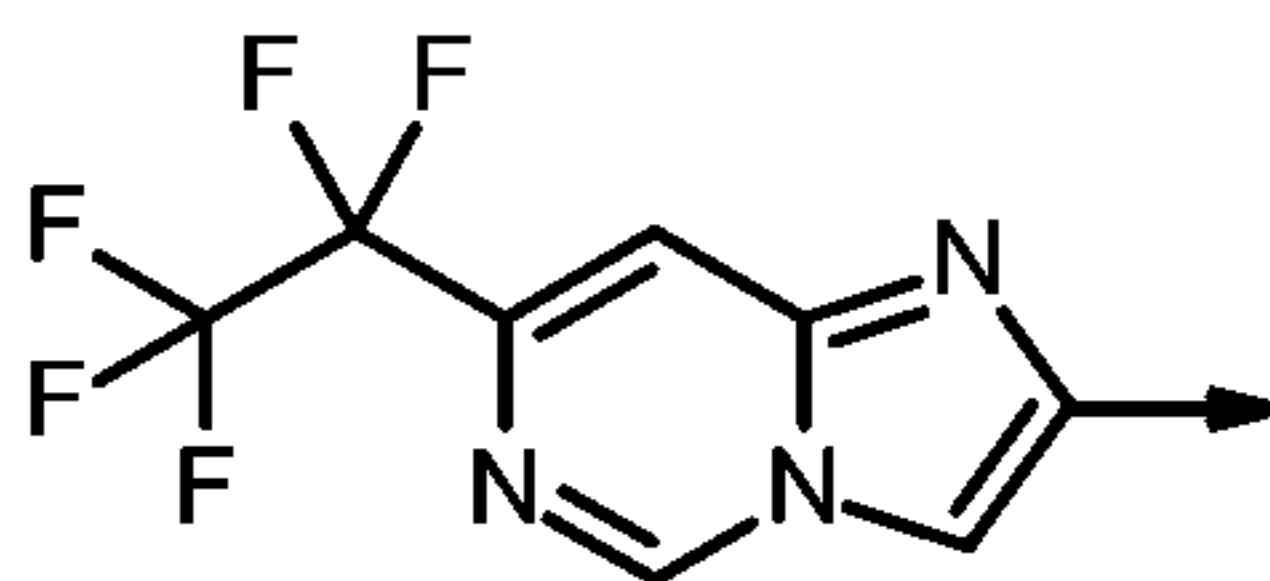
表A-12提供了6種式I的化合物A-12.001至A-12.006，其中R₁係乙基，R₁₀係氫，並且n、A、R₉、R₇和R₈係如在表X中所定義的，並且Q取自式Q₅的基團，為



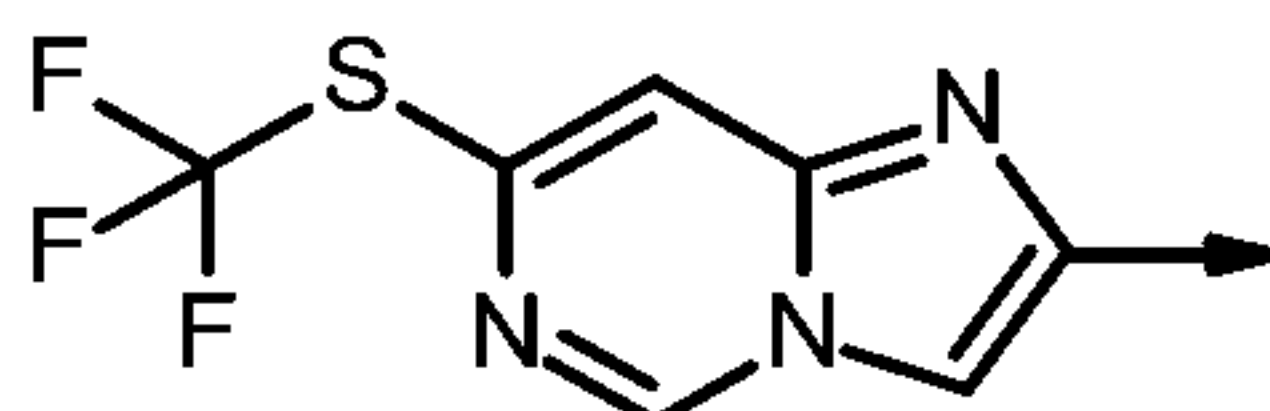
表A-13提供了6種式I的化合物A-13.001至A-13.006，其中R₁係乙基，R₁₀係氫，並且n、A、R₉、R₇和R₈係如在表X中所定義的，並且Q取自式Q₅的基團，為



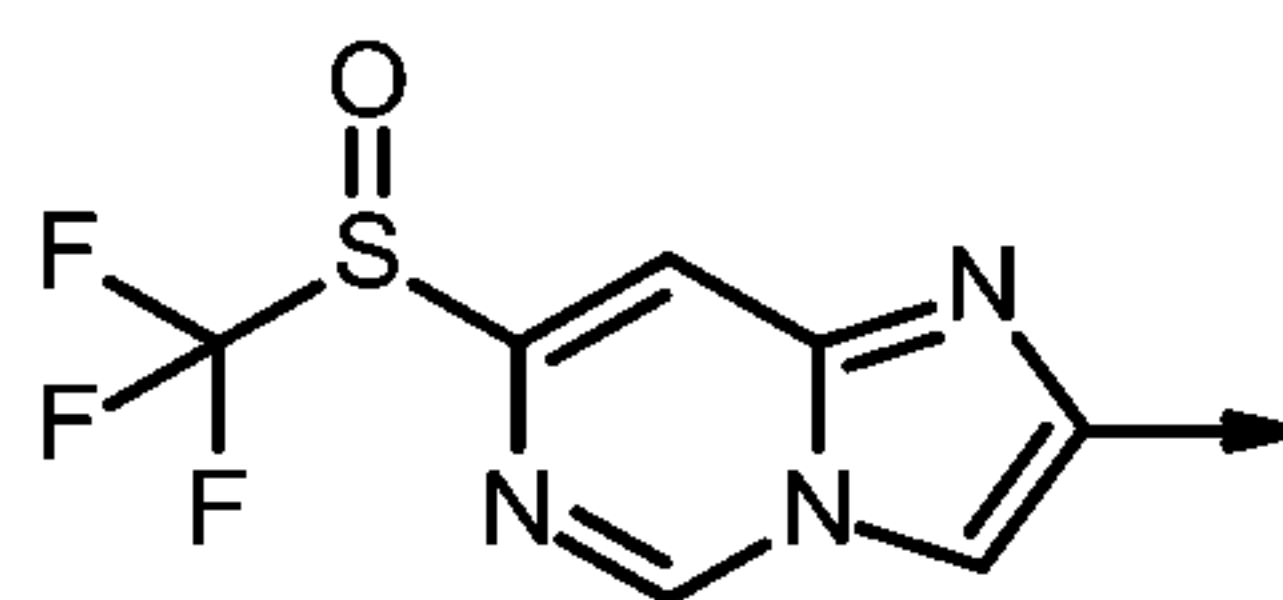
表A-14提供了6種式I的化合物A-14.001至A-14.006，其中R₁係乙基，R₁₀係氫，並且n、A、R₉、R₇和R₈係如在表X中所定義的，並且Q取自式Q₂的基團，為



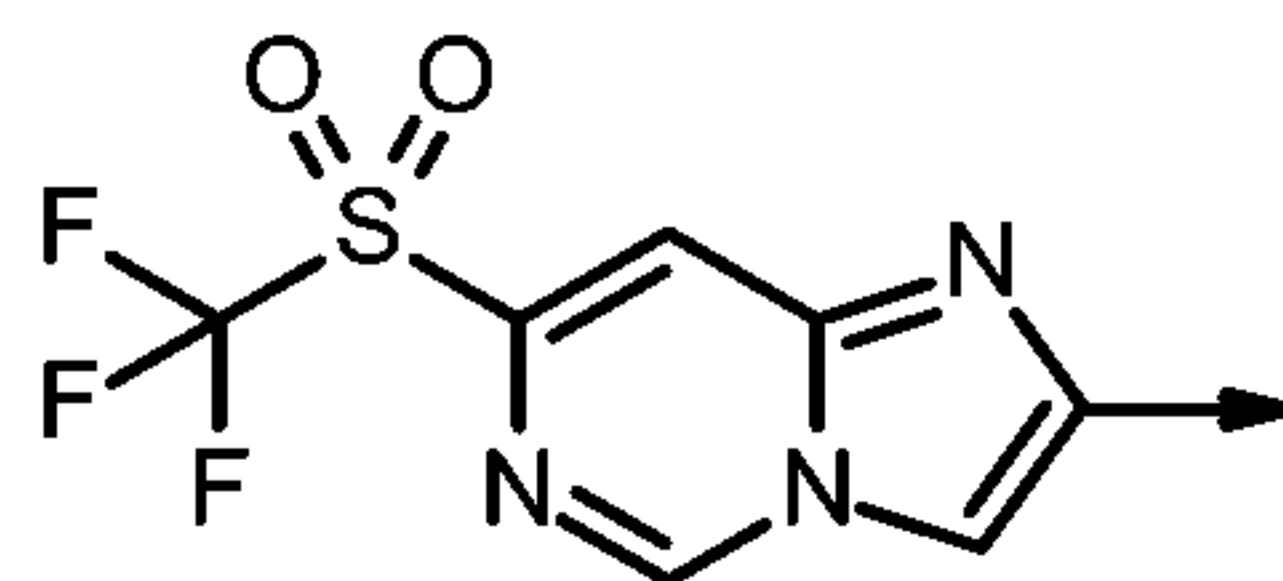
表A-15提供了6種式I的化合物A-15.001至A-15.006，其中R₁係乙基，R₁₀係氫，並且n、A、R₉、R₇和R₈係如在表X中所定義的，並且Q取自式Q₂的基團，為



表A-16提供了6種式I的化合物A-16.001至A-16.006，其中R₁係乙基，R₁₀係氫，並且n、A、R₉、R₇和R₈係如在表X中所定義的，並且Q取自式Q₂的基團，為



表A-17提供了6種式I的化合物A-17.001至A-17.006，其中R₁係乙基，R₁₀係氫，並且n、A、R₉、R₇和R₈係如在表X中所定義的，並且Q取自式Q₂的基團，為



【0181】 根據本發明的式I的化合物在有害生物防治領域中係有預防和/或治療價值的活性成分（即使係在低的施用量下），該等成分具有非常有利的殺生物譜並且是溫血物種、魚和植物良好耐受的。根據本發明的活性成分對通常敏感而且還抗性的動物有害生物（諸如昆蟲或蜱蟎目的代表、線蟲或軟體動物）的全部或單獨的發育階段起作用。根據本發明的活性成分的殺昆蟲、殺線蟲、殺軟體動物或殺蟎活性可以本身直接顯化，即顯化為有害生物的死亡或破壞，這可以立即發生或僅在一段時間後例如在蛻皮過程中發生，或者間接地顯化為例如降低的產卵和/或孵化率、拒食作用、和/或生長抑制。

【0182】 上述動物有害生物的實例係：

來自蜱蟎目，例如

下毛癭蟎屬物種（*Acalitus spp*）、針刺癭蟎屬物種（*Aculus spp*）、窄癭蟎屬物種（*Acaricalus spp.*）、瘤癭蟎屬物種（*Aceria spp.*）、粗腳粉蟎（*Acarus siro*）、鈍眼蜱屬物種（*Amblyomma spp.*）、銳緣蜱屬物種（*Argas spp.*）、牛蜱屬物種（*Boophilus spp.*）、短須蟎屬物種（*Brevipalpus spp.*）、苔蟎屬物種（*Bryobia spp*）、上三脊癭蟎屬物種（*Calipitrimerus spp.*）、皮蟎屬物種（*Chorioptes spp.*）、雞皮刺蟎（*Dermanyssus gallinae*）、表皮蟎屬物種（*Dermatophagoides spp*）、始葉蟎屬物種（*Eotetranychus spp*）、癭蟎屬物種（*Eriophyes spp.*）、半跗線蟎屬物種（*Hemitarsonemus spp*）、璃眼蜱屬物種（*Hyalomma spp.*）、硬蜱屬物種（*Ixodes*

spp.)、小爪蟎屬物種 (*Olygonychus* spp.)、鈍緣蜱屬物種 (*Ornithodoros* spp.)、側多食跗線蟎 (*Polyphagotarsonne latus*)、全爪蟎屬物種 (*Panonychus* spp.)、桔藝鏽蟎 (*Phyllocoptruta oleivora*)、植食蟎屬物種 (*Phytonemus* spp.)、多食跗線蟎屬物種 (*Polyphagotarsonemus* spp.)、癢蟎屬物種 (*Psoroptes* spp.)、扇頭蜱屬物種 (*Rhipicephalus* spp.)、根蟎屬物種 (*Rhizoglyphus* spp.)、疥蟎屬物種 (*Sarcoptes* spp.)、狹跗線蟎屬物種 (*Steneotarsonemus* spp.)、跗線蟎屬物種 (*Tarsonemus* spp.) 以及葉蟎屬物種 (*Tetranychus* spp.) ；

來自虱目，例如

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

來自鞘翅目，例如

叩甲屬物種 (*Agriotes* spp.)、歐洲鯉角金龜 (*Amphimallon majale*)、東方異麗金龜 (*Anomala orientalis*)、花象屬物種 (*Anthonomus* spp.)、蜉金龜屬物種 (*Aphodius* spp.)、玉米擬花螢 (*Astylus atromaculatus*)、金龜屬物種 (*Ataenius* spp.)、甜菜隱食甲 (*Atomaria linearis*)、甜菜脛跳甲 (*Chaetocnema tibialis*)、螢葉甲屬物種 (*Cerotoma* spp.)、寬胸叩頭蟲屬物種 (*Conoderus* spp.)、根頸象屬物種 (*Cosmopolites* spp.)、綠花金龜 (*Cotinis nitida*)、象蟲屬物種 (*Curculio* spp.)、圓頭犀金龜屬物種 (*Cyclocephala* spp.)、皮蠹屬物種 (*Dermestes* spp.)、根螢葉甲屬物種 (*Diabrotica* spp.)、阿根廷兜蟲 (*Diloboderus abderus*)、食植瓢蟲屬物種 (*Epilachna* spp.)、*Eremnus*屬物種、黑異爪蔗金龜 (*Heteronychus arator*)、咖啡果小蠹 (*Hypothenemus hampei*)、*Lagria vilosa*、馬鈴薯甲蟲 (*Leptinotarsa decemLineata*)、稻水象屬物種 (*Lissorhoptrus* spp.)、*Liogenys*屬物種、*Maecolaspis*屬物種、栗色絨金龜 (*Maladera castanea*)、美洲葉甲屬物

種 (*Megascelis* spp.)、油菜花露尾甲 (*Melighetes aeneus*)、鰓金龜屬物種 (*Melolontha* spp.)、*Myochrous armatus*、鋸穀盜屬物種 (*Orycaophilus* spp.)、耳喙象屬物種 (*Otiorhynchus* spp.)、鰓角金龜屬物種 (*Phyllophaga* spp.)、斑象屬物種 (*Phlyctinus* spp.)、弧麗金龜屬物種 (*Popillia* spp.)、蚤跳甲屬物種 (*Psylliodes* spp.)、*Rhyssomatus aubtilis*、劫根蟲屬物種 (*Rhizopertha* spp.)、金龜子科 (*Scarabeidae*)、米象屬物種 (*Sitophilus* spp.)、麥蛾屬物種 (*Sitotroga* spp.)、偽切根蟲屬物種 (*Somaticus* spp.)、尖隱喙象屬物種 (*Sphenophorus* spp.)、大豆莖象 (*Sternechus subsignatus*)、擬步行蟲屬物種 (*Tenebrio* spp.)、擬穀盜屬物種 (*Tribolium* spp.) 以及斑皮蟲屬物種 (*Trogoderma* spp.) ；

來自雙翅目，例如

伊蚊屬物種 (*Aedes* spp.)、瘧蚊屬物種 (*Anopheles* spp.)、高粱芒蚊 (*Antherigona soccata*)、橄欖果實蠅 (*Bactrocea oleae*)、花園毛蚊 (*Bibio hortulanus*)、遲眼蕈蚊屬物種 (*Bradysia* spp.)、紅頭麗蠅 (*Calliphora erythrocephala*)、小條實蠅屬物種 (*Ceratitis* spp.)、金蠅屬物種 (*Chrysomyia* spp.)、庫蚊屬物種 (*Culex* spp.)、黃蠅屬物種 (*Cuterebra* spp.)、寡鬚實蠅屬物種 (*Dacus* spp.)、地種蠅屬物種 (*Delia* spp.)、黑腹果蠅 (*Drosophila melanogaster*)、廁蠅屬物種 (*Fannia* spp.)、胃蠅屬物種 (*Gastrophilus* spp.)、*Geomyza tripunctata*、舌蠅屬物種 (*Glossina* spp.)、皮蠅屬物種 (*Hypoderma* spp.)、虱蠅屬物種 (*Hyppobosca* spp.)、斑潛蠅屬物種 (*Liriomyza* spp.)、綠蠅屬物種 (*Lucilia* spp.)、黑潛蠅屬物種 (*Melanagromyza* spp.)、家蠅屬物種 (*Musca* spp.)、狂蠅屬物種 (*Oestrus* spp.)、癭蚊屬物種 (*Orseolia* spp.)、瑞典麥稈蠅 (*Oscinella frit*)、藜泉蠅 (*Pegomyia hyoscyami*)、草種蠅屬物種 (*Phorbia* spp.)、繞實蠅屬物種 (*Rhagoletis* spp.)、*Rivelia quadrifasciata*、*Scatella*屬物種、尖眼蕈蚊屬物種 (*Sciara* spp.)、螫蠅屬物種 (*Stomoxys* spp.)、虻屬物種 (*Tabanus* spp.)、條蟲屬物種

(*Tannia* spp.) 以及大蚊屬物種 (*Tipula* spp.) ；

來自半翅目，例如

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

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

(*Bactericera cockerelli*)、小粉虱屬物種 (*Bemisia* spp)、短尾蚜屬物種 (*Brachycaudus* spp.)、甘藍蚜(*Brevicoryne brassicae*)、喀木虱屬物種(*Cacopsylla* spp)、雙尾蚜 (*Cavariella aegopodii* Scop.)、蠟蚧屬物種 (*Ceroplaster* spp.)、黑褐圓盾蚧 (*Chrysomphalus aonidium*)、橙褐圓盾蚧 (*Chrysomphalus dictyospermi*)、大葉蟬屬物種 (*Cicadella* spp)、大白葉蟬 (*Cofana spectra*)、隱瘤蚜屬物種(*Cryptomyzus* spp)、葉蟬屬物種(*Cicadulina* spp)、褐軟蚧(*Coccus hesperidum*)、玉米黃翅葉蟬(*Dalbulus maidis*)、裸粉虱屬物種(*Dialeurodes* spp)、柑橘木虱 (*Diaphorina citri*)、麥雙尾蚜 (*Diuraphis noxia*)、西圓尾蚜屬物種 (*Dysaphis* spp)、小綠葉蟬屬物種 (*Empoasca* spp.)、蘋果綿蚜 (*Eriosoma larigerum*)、葡萄斑葉蟬屬物種 (*Erythroneura* spp.)、Gascardia屬物種、赤桉木虱 (*Glycaspis brimblecombei*)、菜縊管蚜 (*Hyadaphis pseudobrassicae*)、大尾蚜屬物種 (*Hyalopterus* spp.)、超瘤蚜種 (*Hyperomyzus pallidus*)、椴果綠葉蟬(*Idioscopus clypealis*)、非洲葉蟬(*Jacobiasca lybica*)、灰飛虱屬物種(*Laodelphax* spp.)、水土堅蚧 (*Lecanium corni*)、蠟盾蚧屬物種 (*Lepidosaphes* spp.)、蘿蔔蚜 (*Lopaphis erysimi*)、*Lyogenys maidis*、長管蚜屬物種 (*Macrosiphum* spp.)、沫蟬屬物種 (*Mahanarva* spp)、蛾蠟蟬科 (*Metcalfa pruinosa*)、麥無網蚜 (*Metopolophium dirhodum*)、麥蠟蟬 (*Myndus crudus*)、瘤蚜屬物種 (*Myzus* spp.)、新聲蚜屬物種 (*Neotoxoptera* sp)、黑尾葉蟬屬物種 (*Nephotettix* spp.)、褐飛虱屬物種 (*Nilaparvata* spp.)、梨大綠蚜 (*Nippolachnus piri* Mats)、*Odonaspis ruthae*、甘蔗棉蚜(*Oregma lanigera* Zehnter)、楊梅緣粉虱(*Parabemisia myricae*)、考氏木虱 (*Paratrioza cockerelli*)、片盾蚧屬物種 (*Parlatoria* spp.)、癭綿蚜屬物種 (*Pemphigus* spp.)、玉米蠟蟬 (*Peregrinus maidis*)、扁角飛虱屬物種 (*Perkinsiella* spp)、忽布疣蚜 (*Phorodon humuli*)、根瘤蚜屬物種 (*Phylloxera* spp)、動性球菌屬物種 (*Planococcus* spp.)、桑白盾蚧屬物種 (*Pseudaulacaspis*

spp.)、粉蚧屬物種(*Pseudococcus* spp.)、棉跳盲蝽(*Pseudatomoscelis seriatus*)、木虱屬物種(*Psylla* spp.)、棉蚧(*Pulvinaria aethiopica*)、齒盾蚧屬物種(*Quadraspidotus* spp.)、*Quesada gigas*、電光葉蟬(*Recilia dorsalis*)、縊管蚜屬物種(*Rhopalosiphum* spp.)、黑盔蚧屬物種(*Saissetia* spp.)、帶葉蟬屬物種(*Scaphoideus* spp.)、二叉蚜屬物種(*Schizaphis* spp.)、麥蚜屬物種(*Sitobion* spp.)、白背飛虱(*Sogatella furcifera*)、三角苜蓿跳蟲(*Spissistilus festinus*)、條斑飛虱(*Tarophagus Proserpina*)、聲蚜屬物種(*Toxoptera* spp.)、粉虱屬物種(*Trialeurodes* spp.)、*Tridiscus sporoboli*、葵粉蚧屬物種(*Trionymus* spp.)、非洲木虱(*Trioza erytrae*)、矢尖蚧(*Unaspis citri*)、火焰斑葉蟬(*Zygina flammigera*)、*Zyginidia scutellaris*；

來自膜翅目，例如

頂切葉蟻屬物種(*Acromyrmex*)、三節葉蜂屬物種(*Arge* spp.)、切葉蟻屬物種(*Atta* spp.)、莖葉蜂屬物種(*Cephus* spp.)、松葉蜂屬物種(*Diprion* spp.)、鋸角葉蜂科(*Diprionidae*)、松葉蜂(*Gilpinia polytoma*)、實葉蜂屬物種(*Hoplocampa* spp.)、毛蟻屬物種(*Lasius* spp.)、小黃家蟻(*Monomorium pharaonis*)、新松葉蜂屬物種(*Neodiprion* spp.)、農蟻屬物種(*Pogonomyrmex* spp.)、紅火蟻(*Slenopsis invicta*)、水蟻屬物種(*Solenopsis* spp.)以及胡蜂屬物種(*Vespa* spp.)；

來自等翅目，例如

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

來自鱗翅目(*Lepidoptera*)，例如，

長翅卷蛾屬物種 (*Acleris* spp.)、褐帶卷蛾屬物種 (*Adoxophyes* spp.)、透翅蛾屬物種 (*Aegeria* spp.)、地夜蛾屬物種 (*Agrotis* spp.)、棉葉蟲 (*Alabama argillaceae*)、*Amylois*屬物種、黎豆夜蛾 (*Anticarsia gemmatalis*)、黃卷蛾屬物種 (*Archips* spp.)、銀蛾屬物種 (*Argyresthia* spp.)、帶卷蛾屬物種 (*Argyrotaenia* spp.)、丫紋夜蛾屬物種 (*Autographa* spp.)、棉潛蛾 (*Bucculatrix thurberiella*)、玉米楷夜蛾 (*Busseola fusca*)、粉斑螟蛾 (*Cadra cautella*)、桃蛀果蛾 (*Carposina nipponensis*)、禾草螟屬物種 (*Chilo* spp.)、色卷蛾屬物種 (*Choristoneura* spp.)、越蔓桔草螟 (*Chrysoteuchia topiaria*)、葡萄果蠹蛾 (*Clysia ambiguella*)、卷葉螟屬物種 (*Cnaphalocrocis* spp.)、雲卷蛾屬物種 (*Cnephasia* spp.)、紋卷蛾屬物種 (*Cochylis* spp.)、鞘蛾屬物種 (*Coleophora* spp.)、籬笆豆粉蝶 (*Colias lesbia*)、小造橋夜蛾 (*Cosmophila flava*)、草螟屬物種 (*Crambus* spp.)、大菜螟 (*Crocidolomia binotalis*)、蘋果異形小卷蛾 (*Cryptophlebia leucotreta*)、黃楊木蛾 (*Cydalima perspectalis*)、小卷蛾屬物種 (*Cydia* spp.)、黃楊絹野螟 (*Diaphania perspectalis*)、桿草螟屬物種 (*Diatraea* spp.)、蘇丹棉鈴蟲 (*Diparopsis castanea*)、鑽夜蛾屬物種 (*Earias* spp.)、甘薯桿螟 (*Eldana saccharina*)、粉斑螟屬物種 (*Ephestia* spp.)、葉小卷蛾屬物種 (*Epinotia* spp.)、鹽澤燈蛾 (*Estigmene acrea*)、*Etiella zinckinella*、花小卷蛾屬物種 (*Eucosma* spp.)、環針單紋卷蛾 (*Eupoecilia ambiguella*)、黃毒蛾屬物種 (*Euproctis* spp.)、切根蟲屬物種 (*Euxoa* spp.)、*Feltia jaculiferia*、小食心蟲屬物種 (*Grapholita* spp.)、雲霧廣翅小卷蛾 (*Hedya nubiferana*)、實夜蛾屬物種 (*Heliothis* spp.)、菜螟 (*Hellula undalis*)、切葉野螟屬物種 (*Herpetogramma* spp.)、美國白蛾 (*Hyphantria cunea*)、番茄蠹蛾 (*Keiferia lycopersicella*)、*Lasmopalpus lignosellus*、旋紋潛葉蛾 (*Leucoptera scitella*)、潛葉細蛾屬物種 (*Lithocollethis* spp.)、葡萄花翅小卷蛾 (*Lobesia botrana*)、*Loxostege bifidalis*、毒蛾屬物種 (*Lymantria* spp.)、潛蛾屬物種 (*Lyonetia* spp.)、

幕枯葉蛾屬物種 (*Malacosoma* spp.)、甘藍夜蛾 (*Mamestra brassicae*)、菸草天蛾 (*Manduca sexta*)、光腹夜蛾屬物種 (*Mythimna* spp.)、夜蛾屬物種 (*Noctua* spp.)、秋尺蛾屬物種 (*Operophtera* spp.)、*Orniodes indica*、歐洲玉米螟 (*Ostrinia nubilalis*)、超小卷蛾屬物種 (*Pammene* spp.)、褐卷蛾屬物種 (*Pandemis* spp.)、小眼夜蛾 (*Panolis flammea*)、蛀莖夜蛾 (*Papaipema nebris*)、紅鈴麥蛾 (*Pectinophora gossypiella*)、咖啡潛葉蛾 (*Perileucoptera coffeella*)、一星黏蟲 (*Pseudaletia unipuncta*)、馬鈴薯麥蛾 (*Phthorimaea operculella*)、菜粉蝶 (*Pieris rapae*)、粉蝶屬物種 (*Pieris* spp.)、小菜蛾 (*Plutella xylostella*)、小白巢蛾屬物種 (*Prays* spp.)、尺葉蛾屬物種 (*Pseudoplusia* spp.)、薄荷灰夜蛾 (*Rachiplusia nu*)、西方豆地香 (*Richia albicosta*)、白禾螟屬物種 (*Scirpophaga* spp.)、蛀莖夜蛾屬物種 (*Sesamia* spp.)、長須卷蛾屬物種 (*Sparganothis* spp.)、灰翅夜蛾屬物種 (*Spodoptera* spp.)、棉大卷葉螟 (*Sylepta derogate*)、興透翅蛾屬物種 (*Synanthedon* spp.)、異舟蛾屬物種 (*Thaumetopoea* spp.)、卷蛾屬物種 (*Tortrix* spp.)、粉紋夜蛾 (*Trichoplusia ni*)、番茄斑潛蠅 (*Tuta absoluta*)、以及巢蛾屬物種 (*Yponomeuta* spp.)；

來自食毛目 (*Mallophaga*)，例如，

畜虱屬物種 (*Damalinea* spp.) 和鬻毛虱屬物種 (*Trichodectes* spp.)；

來自直翅目 (*Orthoptera*)，例如，

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

來自鬻蟲目 (*Psocoptera*)，例如，

虱鬻屬物種 (*Liposcelis* spp.)；

來自蚤目 (*Siphonaptera*)，例如，

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

來自纓翅目 (*Thysanoptera*)，例如，

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

【0183】 來自纓尾目 (*Thysanura*)，例如，衣魚 (*Lepisma saccharina*)。

【0184】 根據本發明的活性成分可用於防治(即遏制或破壞)上述類型的有害生物，該等有害生物特別出現在植物上，尤其是在農業中、在園藝中以及在林業中的有用的植物和觀賞植物上，或者在此類植物的器官(諸如果實、花、葉、莖、塊莖或根)上，並且在一些情況下，甚至在隨後的時間點形成的植物器官仍保持受保護以抵抗該等有害生物。

【0185】 特別地，合適的目標作物係，穀物，諸如小麥、大麥、黑麥、燕麥、稻、玉米或高粱；甜菜，諸如糖用甜菜或飼料甜菜；水果，例如梨果、核果或無核小果，諸如蘋果、梨、李子、桃、杏仁、櫻桃或漿果，例如草莓、覆盆子或黑莓；豆科作物，諸如菜豆、小扁豆、豌豆或大豆；油料作物，諸如油菜、芥菜、罌粟、橄欖、向日葵、椰子、蓖麻、可可或落花生；瓜類作物，諸如南瓜、黃瓜或甜瓜；纖維植物，諸如棉花、亞麻、大麻或黃麻；柑橘類水果，諸如橙、檸檬、葡萄柚或橘子；蔬菜，諸如菠菜、萵苣、蘆筍、捲心菜、胡蘿蔔、洋蔥、番茄、馬鈴薯或甜椒；樟科，諸如鱧梨、肉桂 (*Cinnamomum*) 或樟腦；以及還有菸草、堅果、咖啡、茄子、甘蔗、茶、胡椒、葡萄藤、蛇麻草、

車前草科以及乳膠植物。

【0186】 本發明的組成物和/或方法還可以用在任何觀賞植物和/或蔬菜作物（包括花、灌木、闊葉樹和常綠植物）上。

【0187】 例如，本發明可以用在以下觀賞植物物種中的任一種上：藿香薊屬物種(*Ageratum* spp.)、假面花屬物種(*Alonsoa* spp.)、銀蓮花屬物種(*Anemone* spp.)、南非葵(*Anisodonteia capsensis*)、春黃菊屬物種(*Anthemis* spp.)、金魚草屬物種(*Antirrhinum* spp.)、紫菀屬物種(*Aster* spp.)、秋海棠屬物種(*Begonia* spp.)（例如麗格海棠(*B. elatior*)、四季秋海棠(*B. semperflorens*)、球根秋海棠(*B. tubéreux*)）、葉子花屬物種(*Bougainvillea* spp.)、雁河菊屬物種(*Brachycome* spp.)、藝薹屬物種(*Brassica* spp.)（觀賞植物）、蒲包草屬物種(*Calceolaria* spp.)、辣椒(*Capsicum annuum*)、長春花(*Catharanthus roseus*)、美人蕉屬物種(*Canna* spp.)、矢車菊屬物種(*Centaurea* spp.)、菊屬物種(*Chrysanthemum* spp.)、瓜葉菊屬物種(*Cineraria* spp.)（銀葉菊(*C. maritime*)）、金雞菊屬物種(*Coreopsis* spp.)、紅景天(*Crassula coccinea*)、火紅萼距花(*Cuphea ignea*)、大麗花屬物種(*Dahlia* spp.)、翠雀屬物種(*Delphinium* spp.)、荷包牡丹(*Dicentra spectabilis*)、彩虹菊屬物種(*Dorotheantus* spp.)、洋桔梗(*Eustoma grandiflorum*)、連翹屬物種(*Forsythia* spp.)、倒掛金鐘屬物種(*Fuchsia* spp.)、老鸛草屬鼠麴草屬(*Geranium gnaphalium*)、大丁草屬物種(*Gerbera* spp.)、千日紅(*Gomphrena globosa*)、天芥菜屬物種(*Heliotropium* spp.)、向日葵屬物種(*Helianthus* spp.)、木槿屬物種(*Hibiscus* spp.)、繡球花屬物種(*Hortensia* spp.)、繡球屬物種(*Hydrangea* spp.)、嫣紅蔓(*Hypoestes phyllostachya*)、鳳仙花屬物種(*Impatiens* spp.)（非洲鳳仙花(*I. Walleriana*)）、血菟屬物種(*Iresines* spp.)、伽藍菜屬物種(*Kalanchoe* spp.)、馬纓丹(*Lantana camara*)、三月花葵(*Lavatera trimestris*)、獅耳花(*Leonotis leonurus*)、百合屬物種(*Lilium*

spp.)、松葉菊屬物種(*Mesembryanthemum* spp.)、溝酸漿屬物種(*Mimulus* spp.)、美國薄荷屬物種(*Monarda* spp.)、龍面花屬物種(*Nemesia* spp.)、萬壽菊屬物種(*Tagetes* spp.)、石竹屬物種(*Dianthus* spp.) (康乃馨)、美人蕉屬物種(*Canna* spp.)、酢漿草屬物種(*Oxalis* spp.)、雛菊屬物種(*Bellis* spp.)、天竺葵屬物種(*Pelargonium* spp.) (盾葉天竺葵(*P. peltatum*)、馬蹄紋天竺葵(*P. Zonale*))、堇菜屬物種(*Viola* spp.) (三色堇)、碧冬茄屬物種(*Petunia* spp.)、草夾竹桃屬物種(*Phlox* spp.)、香茶菜屬物種(*Plecthranthus* spp.)、一品紅屬物種(*Poinsettia* spp.)、爬山虎屬物種(*Parthenocissus* spp.) (五葉爬山虎(*P. quinquefolia*)、爬山虎(*P. tricuspidata*))、報春花屬物種(*Primula* spp.)、毛茛屬物種(*Ranunculus* spp.)、杜鵑花屬物種(*Rhododendron* spp.)、薔薇屬物種(*Rosa* spp.) (玫瑰)、黃雛菊屬物種(*Rudbeckia* spp.)、非洲堇屬物種(*Saintpaulia* spp.)、鼠尾草屬物種(*Salvia* spp.)、紫扇花(*Scaevola aemola*)、蛾蝶花(*Schizanthus wisetonensis*)、景天屬物種(*Sedum* spp.)、茄屬物種(*Solanum* spp.)、蘇非尼亞矮牽牛屬物種(*Surfinia* spp.)、萬壽菊屬物種(*Tagetes* spp.)、菸草屬物種(*Nicotinia* spp.)、馬鞭草屬物種(*Verbena* spp.)、百日草屬物種(*Zinnia* spp.) 以及其他花壇植物。

【0188】 例如，本發明可以用在以下蔬菜物種中的任一種上：蔥屬物種(*Allium* spp.) (大蒜(*A. sativum*)、洋蔥(*A. cepa*)、*A. oschaninii*、韭蔥(*A. Porrum*)、火蔥(*A. ascalonicum*)、大蔥(*A. fistulosum*))、茴香芹(*Anthriscus cerefolium*)、旱芹(*Apium graveolus*)、蘆筍(*Asparagus officinalis*)、甜菜(*Beta vulgaris*)、蕓薹屬物種(*Brassica* spp.) (甘藍(*B. Oleracea*)、大白菜(*B. Pekinensis*)、蕪菁(*B. rapa*))、辣椒(*Capsicum annum*)、鷹嘴豆(*Cicer arietinum*)、苦苣(*Cichorium endivia*)、菊苣屬物種(*Cichorium* spp.) (菊苣(*C. intybus*)、苦苣(*C. endivia*))、西瓜(*Citrillus lanatus*)、黃瓜屬物種(*Cucumis*

spp.) (黃瓜 (*C. sativus*)、甜瓜 (*C. melo*))、南瓜屬物種 (*Cucurbita* spp.) (西葫蘆 (*C. pepo*)、印度南瓜 (*C. maxima*))、菜薊屬物種 (*Cyanara* spp.) (朝鮮薊 (*C. scolymus*)、刺苞菜薊 (*C. cardunculus*))、野胡蘿蔔 (*Daucus carota*)、茴香 (*Foeniculum vulgare*)、金絲桃屬物種 (*Hypericum* spp.)、萵苣 (*Lactuca sativa*)、番茄屬物種 (*Lycopersicon* spp.) (番茄 (*L. esculentum*)、聖女果番茄 (*L. lycopersicum*))、薄荷屬物種 (*Mentha* spp.)、羅勒 (*Ocimum basilicum*)、香芹 (*Petroselinum crispum*)、菜豆屬物種 (*Phaseolus* spp.) (菜豆 (*P. vulgaris*)、荷包豆 (*P. coccineus*))、豌豆 (*Pisum sativum*)、蘿蔔 (*Raphanus sativus*)、食用大黃 (*Rheum rhaponticum*)、迷迭香屬物種 (*Rosemarinus* spp.)、鼠尾草屬物種 (*Salvia* spp.)、黑婆羅門參 (*Scorzonera hispanica*)、茄子 (*Solanum melongena*)、菠菜 (*Spinacea oleracea*)、新纈草屬物種 (*Valerianella* spp.) (萵苣纈草 (*V. locusta*)、*V. eriocarpa*) 以及蠶豆 (*Vicia faba*)。

【0189】較佳的觀賞植物物種包括非洲堇 (African violet)、秋海棠屬 (*Begonia*)、大麗花屬 (*Dahlia*)、大丁草屬 (*Gerbera*)、繡球屬 (*Hydrangea*)、馬鞭草屬 (*Verbena*)、薔薇屬 (*Rosa*)、伽藍菜屬 (*Kalanchoe*)、一品紅屬 (*Poinsettia*)、紫菀屬 (*Aster*)、矢車菊屬 (*Centaurea*)、金雞菊屬 (*Coreopsis*)、翠雀屬 (*Delphinium*)、美國薄荷屬 (*Monarda*)、草夾竹桃屬 (*Phlox*)、黃雛菊屬 (*Rudbeckia*)、景天屬 (*Sedum*)、碧冬茄屬 (*Petunia*)、堇菜屬 (*Viola*)、鳳仙花屬 (*Impatiens*)、老鸛草屬 (*Geranium*)、菊屬 (*Chrysanthemum*)、毛茛屬 (*Ranunculus*)、倒掛金鐘屬 (*Fuchsia*)、鼠尾草屬 (*Salvia*)、繡球花屬 (*Hortensia*)、迷迭香、鼠尾草、聖約翰草 (St. Johnswort)、薄荷 (mint)、甜椒 (sweet pepper)、番茄和黃瓜 (cucumber)。

【0190】根據本發明的該等活性成分尤其適合於防治棉花、蔬菜、玉米、水稻以及大豆作物上的扁豆蚜 (*Aphis craccivora*)、黃瓜條葉甲 (*Diabrotica*

balteata)、煙芽夜蛾 (*Heliothis virescens*)、桃蚜 (*Myzus persicae*)、小菜蛾 (*Plutella xylostella*) 以及海灰翅夜蛾 (*Spodoptera littoralis*)。根據本發明的該等活性成分另外尤其適合於防治甘藍夜蛾屬 (*Mamestra*) (較佳的是在蔬菜上)、蘋果蠹蛾 (*Cydia pomonella*) (較佳的是在蘋果上)、小綠葉蟬屬 (*Empoasca*) (較佳的是在蔬菜、葡萄園裡)、瘦跗葉甲屬 (*Leptinotarsa*) (較佳的是在馬鈴薯上) 以及二化螟 (*Chilo suppressalis*) (較佳的是在水稻上)。

【0191】 根據本發明的該等活性成分尤其適合於防治棉花、蔬菜、玉米、水稻以及大豆作物上的扁豆蚜 (*Aphis craccivora*)、黃瓜條葉甲 (*Diabrotica balteata*)、煙芽夜蛾 (*Heliothis virescens*)、桃蚜 (*Myzus persicae*)、小菜蛾 (*Plutella xylostella*) 以及海灰翅夜蛾 (*Spodoptera littoralis*)。根據本發明的該等活性成分另外尤其適合於防治甘藍夜蛾屬 (*Mamestra*) (較佳的是在蔬菜上)、蘋果蠹蛾 (*Cydia pomonella*) (較佳的是在蘋果上)、小綠葉蟬屬 (*Empoasca*) (較佳的是在蔬菜、葡萄園裡)、瘦跗葉甲屬 (*Leptinotarsa*) (較佳的是在馬鈴薯上) 以及二化螟 (*Chilo suppressalis*) (較佳的是在水稻上)。

【0192】 在另一方面中，本發明還可涉及一種防治由植物寄生線蟲 (內寄生線蟲、半內寄生線蟲和外寄生線蟲) 對植物及其部分的損害的方法，尤其是以下植物寄生線蟲，如根結線蟲 (root knot nematodes)、北方根結線蟲 (*Meloidogyne hapla*)、南方根結線蟲 (*Meloidogyne incognita*)、爪哇根結線蟲 (*Meloidogyne javanica*)、花生根結線蟲 (*Meloidogyne arenaria*) 以及其他根結線蟲屬物種；孢囊形成線蟲 (cyst-forming nematodes)、馬鈴薯金線蟲 (*Globodera rostochiensis*) 以及其他球孢囊線蟲屬 (*Globodera*) 物種；禾穀孢囊線蟲 (*Heterodera avenae*)、大豆孢囊線蟲 (*Heterodera glycines*)、甜菜孢囊線蟲 (*Heterodera schachtii*)、紅三葉異皮線蟲 (*Heterodera trifolii*)、以及其他異皮線蟲屬 (*Heterodera*) 物種；種癭線蟲 (Seed gall nematodes)、粒線蟲屬 (*Anguina*)

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

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

【0193】 本發明的化合物還可具有針對軟體動物的活性。其實例包括例如福壽螺科 (*Ampullariidae*)；蛞蝓科 (*Arion*) (黑蛞蝓 (*A. ater*)、環狀蛞蝓 (*A. circumscriptus*)、棕阿勇蛞蝓 (*A. hortensis*)、紅蛞蝓 (*A. rufus*))；巴蝸牛科 (*Bradybaenidae*) (灌木巴蝸牛 (*Bradybaena fruticum*))；蔥蝸牛屬 (*Cepaea*) (花園蔥蝸牛 (*C. hortensis*)、森林蔥蝸牛 (*C. Nemoralis*))；*ochlodina*；野蛞蝓屬 (*Deroceras*) (野灰蛞蝓 (*D. agrestis*)、*D. empiricorum*、光滑野蛞蝓 (*D. laeve*)、網紋野蛞蝓 (*D. reticulatum*))；圓盤螺屬 (*Discus*) (圓形圓盤蝸牛 (*D. rotundatus*))；*Euomphalia*；土蝸屬 (*Galba*) (截口土蝸 (*G. trunculata*))；小蝸牛屬 (*Helicelia*) (伊塔拉小蝸牛 (*H. itala*)、布維小蝸牛 (*H. obvia*))；大蝸牛科 (*Helicidae*) (*Helicigona arbustorum*)；*Helicodiscus*；大蝸牛 (*Helix*) (開口大蝸牛 (*H. aperta*))；蛞蝓屬 (*Limax*) (利邁科斯蛞蝓 (*L. cinereoniger*)、黃蛞蝓 (*L. flavus*)、邊緣蛞蝓 (*L. marginatus*)、大蛞蝓 (*L. maximus*)、柔蛞蝓 (*L. tenellus*))；椎實螺屬 (*Lymnaea*)；*Milax* (小蛞蝓科) (黑色小蛞蝓 (*M. gagates*)、邊緣小蛞蝓 (*M. marginatus*)、碩氏小蛞蝓 (*M. sowerbyi*))；鑽螺屬 (*Opeas*)；瓶螺屬 (*Pomacea*) (福壽螺 (*P. canaticulata*))；瓦婁蝸牛

屬（*Vallonia*）和*Zanitoides*。

【0194】 術語「作物」應當理解為還包括已經藉由使用重組DNA技術而被這樣轉形使得其能夠合成一種或多種選擇性作用毒素的作物植物，該等毒素係如已知例如來自於產毒素細菌，尤其是芽孢桿菌屬的那些細菌。

【0195】 可由此類轉基因植物表現的毒素包括例如殺昆蟲蛋白，例如來自蠟樣芽孢桿菌（*Bacillus cereus*）或日本金龜子芽孢桿菌（*Bacillus popilliae*）的殺昆蟲蛋白；或者來自蘇雲金芽孢桿菌（*Bacillus thuringiensis*）的殺昆蟲蛋白，諸如 δ -內毒素，例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C，或者植物性殺昆蟲蛋白（Vip），例如Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A；或細菌菌落形成線蟲的殺昆蟲蛋白，例如光桿狀菌屬某些種（*Photorhabdus* spp.）或致病桿菌屬某些種（*Xenorhabdus* spp.），諸如發光桿菌（*Photorhabdus luminescens*）、嗜線蟲致病桿菌（*Xenorhabdus nematophilus*）；由動物產生的毒素，諸如蠍毒素、蛛毒素、蜂毒素和其他昆蟲特異性神經毒素；由真菌產生的毒素，諸如鏈黴菌毒素，植物凝集素類（lectin），諸如豌豆凝集素、大麥凝集素或雪花蓮凝集素；凝集素（agglutinin）；蛋白酶抑制劑，諸如胰蛋白酶抑制劑、絲胺酸蛋白酶抑制劑、馬鈴薯糖蛋白、朊抑素、木瓜蛋白酶抑制劑；核糖體失活蛋白（RIP），諸如蓖麻毒素、玉米-RIP、相思豆毒素、絲瓜籽蛋白、皂草素或異株瀉根毒蛋白；類固醇代謝酶，諸如3-羥基類固醇氧化酶、蛻化類固醇-UDP-糖苷基-轉移酶、膽固醇氧化酶、蛻化素抑制劑、HMG-COA-還原酶、離子通道阻斷劑諸如鈉通道或鈣通道阻斷劑、保幼激素酯酶、利尿激素受體、萜合成酶、聯苳合成酶、幾丁質酶和葡聚糖酶。

【0196】 在本發明的上下文中， δ -內毒素（例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C）或植物性殺昆蟲蛋白（Vip）（例如Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A）應理解為顯然還包括混合型毒素、截短的毒素和

經修飾的毒素。混合型毒素係藉由那些蛋白的不同結構域的新組合重組產生的（參見例如，WO 02/15701）。截短的毒素，例如截短的Cry1Ab係已知的。在經修飾的毒素的情況下，天然存在的毒素的一個或多個胺基酸被置換。在這種胺基酸置換中，較佳的是將非天然存在的蛋白酶識別序列插入毒素中，例如像在Cry3A055的情況下，組織蛋白酶-G-識別序列被插入Cry3A毒素中（參見WO 03/018810）。

【0197】 此類毒素或能夠合成此類毒素的轉基因植物的實例揭露於例如EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451 878以及WO 03/052073中。

【0198】 用於製備此類轉基因植物的方法通常是熟悉該項技術者已知的並且描述在例如以上提及的公開物中。CryI型去氧核糖核酸及其製備例如從WO 95/34656、EP-A-0 367 474、EP-A-0 401 979和WO 90/13651中已知。

【0199】 轉基因植物中所含的毒素使得植物對有害昆蟲有耐受性。此類昆蟲可以存在於任何昆蟲分類群，但尤其常見於甲蟲（鞘翅目（Coleoptera））、雙翅昆蟲（雙翅目（Diptera））和蛾（鱗翅目）。

【0200】 含有一種或多種編碼殺昆蟲劑抗性並且表現一種或多種毒素的基因的轉基因植物係已知的並且其中一些係可商購的。此類植物的實例係：YieldGard®（玉米品種，表現Cry1Ab毒素）；YieldGard Rootworm®（玉米品種，表現Cry3Bb1毒素）；YieldGard Plus®（玉米品種，表現Cry1Ab和Cry3Bb1毒素）；Starlink®（玉米品種，表現Cry9C毒素）；Herculex I®（玉米品種，表現Cry1Fa2毒素和獲得對除草劑草銨磷銨的耐受性的酶磷絲菌素N-乙醯基轉移酶（PAT））；NuCOTN 33B®（棉花品種，表現Cry1Ac毒素）；Bollgard I®（棉花品種，表現Cry1Ac毒素）；Bollgard II®（棉花品種，表現Cry1Ac和Cry2Ab毒素）；VipCot®（棉花品種，表現Vip3A和Cry1Ab毒素）；NewLeaf®（馬鈴薯品種，表現Cry3A

毒素)；NatureGard®、Agrisure® GT Advantage(GA21耐草甘膦性狀)、Agrisure® CB Advantage (Bt11玉米螟 (CB) 性狀) 以及Protecta®。

此類轉基因作物的另外的實例係：

【0201】 1. **Bt11玉米**，來自先正達種子公司 (Syngenta Seeds SAS)，霍比特路 (Chemin de l'Hobit) 27，F-31 790聖蘇維爾 (St. Sauveur)，法國，登記號C/FR/96/05/10。遺傳修飾的玉蜀黍 (*Zea mays*)，已經藉由轉基因表現截短的Cry1Ab毒素，使之能抵抗歐洲玉米螟 (玉米螟和粉莖螟 (*Sesamia nonagrioides*)) 的侵襲。Bt11玉米還轉基因表現PAT酶以獲得對除草劑草銨磷銨的耐受性。

【0202】 2. **Bt176玉米**，來自先正達種子公司 (Syngenta Seeds SAS)，霍比特路 (Chemin de l'Hobit) 27，F-31 790聖蘇維爾 (St. Sauveur)，法國，登記號C/FR/96/05/10。遺傳修飾的玉蜀黍，藉由轉基因表現Cry1Ab毒素，使之能抵抗歐洲玉米螟 (玉米螟和粉莖螟) 的侵襲。Bt176玉米還轉基因表現PAT酶以獲得對除草劑草銨磷銨的耐受性。

【0203】 3. **MIR604玉米**，來自先正達種子公司 (Syngenta Seeds SAS)，霍比特路 (Chemin de l'Hobit) 27，F-31 790聖蘇維爾 (St. Sauveur)，法國，登記號C/FR/96/05/10。藉由轉基因表現經修飾的Cry3A毒素使之具有昆蟲抗性的玉米。此毒素係藉由插入組織蛋白酶-G-蛋白酶識別序列而修飾的Cry3A055。此類轉基因玉米植物的製備描述於WO 03/018810中。

【0204】 4. **MON 863玉米**，來自孟山都歐洲公司 (Monsanto Europe S.A.)，270-272 特弗倫大道 (Avenue de Tervuren)，B-1150 布魯塞爾，比利時，登記號C/DE/02/9。MON 863表現Cry3Bb1毒素，並且對某些鞘翅目昆蟲有抗性。

【0205】 5. **IPC 531棉花**，來自孟山都歐洲公司 (Monsanto Europe S.A.)，270-272特弗倫大道 (Avenue de Tervuren)，B-1150 布魯塞爾，比利時，登記號C/ES/96/02。

【0206】 6. **1507玉米**，來自先鋒海外公司（Pioneer Overseas Corporation），特德斯科大道（Avenue Tedesco），7 B-1160 布魯塞爾，比利時，登記號C/NL/00/10。遺傳修飾的玉米，表現蛋白質Cry1F以獲得對某些鱗翅目昆蟲的抗性，並且表現PAT蛋白質以獲得對除草劑草銨磷銨的耐受性。

【0207】 7. **NK603 × MON 810玉米**，來自孟山都歐洲公司（Monsanto Europe S.A.），270-272 特弗倫大道（Avenue de Tervuren），B-1150 布魯塞爾，比利時，登記號C/GB/02/M3/03。由常規育種的雜交玉米品種（藉由將遺傳修飾的品種NK603和MON 810雜交）組成。NK603 × MON 810玉米轉基因地表現由土壤桿菌屬（*Agrobacterium sp.*）菌株CP4獲得的蛋白質CP4 EPSPS（該蛋白質使得具有對除草劑Roundup®（含有草甘膦）的耐受性）以及還有由蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克亞種（*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*）獲得的Cry1Ab毒素（該毒素帶來對某些鱗翅目（包括歐洲玉米螟）的耐受性）。

【0208】 抗昆蟲性植物的轉基因作物還描述於BATS（生物安全與可持續發展中心（Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit），BATS中心（Zentrum BATS），克拉斯崔舍（Clarastrasse）13，巴塞爾（Basel）4058，瑞士）報告2003（<http://bats.ch>）中。

【0209】 術語「作物」應理解為還包括已經藉由使用重組DNA技術而被這樣轉形使得其能夠合成具有選擇性作用的抗病原物質的作物植物，該等抗病原物質係例如像所謂的「病程相關蛋白」（PRP，參見例如EP-A-0 392 225）。此類抗病原物質和能夠合成此類抗病原物質的轉基因植物的實例係例如從EP-A-0 392 225、WO 95/33818和EP-A-0 353 191已知的。生產此類轉基因植物的方法對於熟悉該項技術者而言通常是已知的並且描述於例如以上提及的公開物中。

【0210】 作物也可以經修飾以增加對真菌（例如鐮孢黴屬、炭疽病或疫黴

屬)、細菌(例如假單胞菌屬)或病毒(例如馬鈴薯卷葉病毒、番茄斑萎病毒、黃瓜花葉病毒)病原體的抗性。

【0211】 作物還包括對線蟲(諸如大豆異皮線蟲)具有增加的抗性的那些作物。

【0212】 具有對非生物性脅迫的耐受性的作物包括例如藉由表現NF-YB或本領域中已知的其他蛋白質而對乾旱、高鹽、高溫、寒冷、霜或光輻射具有增加的耐受性的那些作物。

【0213】 可由此類轉基因植物表現的抗病原物質包括例如離子通道阻斷劑,諸如鈉通道和鈣通道的阻斷劑,例如病毒KP1、KP4或KP6毒素;萜合成酶;聯苳合成酶;幾丁質酶;葡聚糖酶;所謂「病程相關蛋白」(PRP;參見例如EP-A-0392 225);由微生物產生的抗病原物質,例如肽抗生素或雜環抗生素(參見例如WO 95/33818)或參與植物病原體防禦的蛋白質或多肽因子(所謂「植物疾病抗性基因」,如WO 03/000906中所描述的)。

【0214】 根據本發明的組成物的其他使用範圍係保護所儲存的物品和儲存室以及保護原材料,諸如木材、紡織品、地板或建築物,以及還在衛生領域中,尤其是保護人類、家畜以及生產性牲畜免受所提及類型的有害生物的侵襲。

【0215】 本發明還提供了一種用於防治有害生物(諸如蚊和其他疾病媒介物;同樣參見http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/)的方法。在一個實施方式中,用於防治有害生物的方法包括藉由塗刷、軋製、噴霧、塗布或浸漬,向目標有害生物、它們的場所或表面或基質施用本發明的組成物。藉由舉例,藉由本發明的方法考慮到了表面(諸如牆、天花板或地板表面)的IRS(室內滯留噴霧)施用。在另一個實施方式中,考慮到了將此類組成物施用於諸如非織造物或織物材料的基質,該材料呈網織品、被覆物、被褥、窗簾以及帳篷的形式(或可以用於製造該等物品)。

【0216】 在一個實施方式中，用於防治此類有害生物的方法包括向目標有害生物、它們的場所或表面或基質施用殺有害生物有效量的本發明的組成物，以便於在該表面或基質上提供有效的滯留的殺有害生物活性。此類施用可以藉由塗刷、軋製、噴霧、塗布或浸漬本發明的殺有害生物組成物來進行。藉由舉例，藉由本發明的方法考慮到了表面（諸如牆、天花板或地板表面）的IRS施用，以便於在該表面上提供有效的滯留的殺有害生物活性。在另一個實施方式中，考慮了施用此類組成物以用於滯留防治在諸如織物材料的基質上的有害生物，該織物材料呈網織品、被覆物、被褥、窗簾以及帳篷的形式（或可以用於製造該等物品）。

【0217】 有待處理的基質（包括非織造物、織物或網織品）可以由以下製成：天然纖維，諸如棉花、拉菲亞樹葉纖維、黃麻、亞麻、劍麻、粗麻布或羊毛，或者合成纖維，諸如聚醯胺、聚酯、聚丙烯、聚丙烯腈等。聚酯係特別合適的。紡織品處理的方法係已知的，例如WO 2008/151984、WO 2003/034823、US 5631072、WO 2005/64072、WO 2006/128870、EP 1724392、WO 2005113886或WO 2007/090739。

【0218】 根據本發明的組成物的其他使用範圍係針對所有觀賞樹木連同所有種類的果樹和堅果樹的樹木注射/樹幹處理領域。

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

[表A].具有經濟重要性的外來蛀木蟲的實例。

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

[表B].具有經濟重要性的本地蛀木蟲的實例。

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

科	種	受侵染的宿主或作物
		子樹、楊樹、溫柏、美國紫荊、唐棣、美國梧桐、核桃樹、柳樹
	<i>Texania campestris</i>	椴木、山毛櫸、楓樹、橡樹、美國梧桐、柳樹、黃楊
天牛科 (Cerambycidae)	對山毛櫸天牛 (<i>Goes pulverulentus</i>)	山毛櫸、榆樹、納托爾(Nuttall)、柳樹、黑橡樹、櫻皮鑷狀櫟、黑櫟、美國梧桐
	虎橡天牛 (<i>Goes tigrinus</i>)	橡樹
	黑腹尼虎天牛 (<i>Neoclytus acuminatus</i>)	白蠟木、山核桃樹、橡樹、核桃樹、樺樹、山毛櫸、楓樹、美洲鐵木 (Eastern hophornbeam)、山茱萸、柿子樹、美國紫荊、冬青、樸樹、洋槐、美國皂莢木 (Honeylocust)、黃楊、栗樹、奧塞奇橙木 (Osage-orange)、黃樟、紫丁香、短葉紫杉 (Mountain-mahogany)、

科	種	受侵染的宿主或作物
		梨樹、櫻桃樹、李子樹、桃樹、蘋果樹、榆樹、菩提樹、楓香
	三線無花果天牛 (<i>Neoptychodes trilineatus</i>)	無花果樹、赤楊木、桑樹、柳樹、網葉樸樹 (Netleaf hackberry)
	灰翅筒天牛 (<i>Oberea ocellata</i>)	漆樹、蘋果樹、桃樹、李子樹、梨樹、紅醋栗樹、黑莓
	三點筒天牛 (<i>Oberea tripunctata</i>)	山茱萸、莢蒾屬、榆樹、酸模樹、藍莓、杜鵑花屬、杜鵑、月桂樹、楊樹、柳樹、桑樹
	繞枝溝脛天牛 (<i>Oncideres cingulata</i>)	山核桃樹、美洲山核桃樹、柿子樹、榆樹、酸模樹、菩提樹、美國皂莢木、山茱萸、桉樹、橡樹、樸樹、楓樹、果樹
	對楊黃斑楔天牛 (<i>Saperda calcarata</i>)	楊樹
	<i>Strophiona nitens</i>	栗樹、橡樹、山核桃樹、核桃樹、山毛櫸、楓樹

科	種	受侵染的宿主或作物
小蠹科	<i>Corthylus columbianus</i>	楓樹、橡樹、黃楊、山毛櫸、白蠟槭、美國梧桐、樺樹、菩提樹、栗樹、榆樹
	南方松大小蠹 (<i>Dendroctonus frontalis</i>)	松樹
	美樺毛小蠹 (<i>Dryocoetes betulae</i>)	樺樹、楓香、野櫻桃樹、山毛櫸、梨樹
	黃帶芳小蠹 (<i>Monarthrum fasciatum</i>)	橡樹、楓樹、樺樹、栗樹、楓香、藍果木、楊樹、山核桃樹、含羞草、蘋果樹、桃樹、松樹
	桃鰓角小蠹 (<i>Phloeotribus liminaris</i>)	桃樹、櫻桃樹、李子樹、黑櫻桃樹、榆樹、桑樹、歐洲花楸樹
	<i>Pseudopityophthorus pruinosus</i>	橡樹、美國山毛櫸木、黑櫻桃樹、契卡索李子樹 (Chickasaw plum)、栗樹、楓樹、山核桃樹、角樹、鐵木
透翅蛾科	棟透翅蛾 (<i>Paranthrene simulans</i>)	橡樹、美洲栗樹

科	種	受侵染的宿主或作物
	<i>Sannina uroceriformis</i>	柿子樹
	小桃翅蛾 (<i>Synanthedon exitiosa</i>)	桃樹、李子樹、油桃樹、櫻桃樹、杏樹、扁桃樹、黑櫻桃樹
	李桃翅蛾 (<i>Synanthedon pictipes</i>)	桃樹、李子樹、櫻桃樹、山毛櫸、黑櫻桃樹
	<i>Synanthedon rubrofascia</i>	藍果樹
	<i>Synanthedon scitula</i>	山茱萸、美洲山核桃、山核桃樹、橡樹、栗樹、山毛櫸、樺樹、黑櫻桃樹、榆樹、歐洲花楸樹、莢蒾屬、柳樹、蘋果樹、枇杷樹、九層皮、楊梅
	葡萄根透翅蛾 (<i>Vitacea polistiformis</i>)	葡萄樹

【0219】 本發明也可以用於防治可以存在於草坪草中的任何昆蟲有害生物，包括例如甲蟲、毛蟲、火蟻、地面珍珠 (ground pearl)、千足蟲、潮蟲、蟪蟲、螻蛄、介殼蟲、粉蚧蟬、沫蟬、南方麥小蝻以及蟻蟻。本發明可以用於防治處於其生命週期的各個階段的昆蟲有害生物，包括卵、幼蟲、若蟲和成蟲。

【0220】 具體而言，本發明可用於防治取食草坪草的根部的昆蟲有害生物，包括蟻蟻 (諸如圓頭犀金龜屬物種 (*Cyclocephala spp.*) (例如隱蔽的金龜子 (masked chafer)、*C. lurida*)、*Rhizotrogus*屬物種 (例如歐洲金龜子，歐洲切根鯁金龜 (*R. majalis*))、黃櫨屬物種 (*Cotinus spp.*) (例如綠六月甲蟲 (Green

第 84 頁，共 195 頁(發明說明書)

June beetle)、綠六月花金龜(*C. nitida*)、弧麗金龜屬物種(*Popillia spp.*) (例如日本甲蟲、日本弧麗金龜(*P. japonica*))、鰓角金龜屬物種(*Phyllophaga spp.*) (例如五月/六月甲蟲)、金龜屬物種(*Ataenius spp.*) (例如草坪草黑金龜(Black turfgrass ataenius)、黑絨金龜(*A. spretulus*))、絨毛金龜屬物種(*Maladera spp.*) (例如亞洲花園甲蟲(Asiatic garden beetle)、栗色絨金龜(*M. castanea*)) 以及Tomarus屬物種)、地面珍珠(碩蚘屬物種(*Margarodes spp.*))、螻蛄(褐黃色的、南方的、以及短翅的；痣蟋蟀屬物種(*Scapteriscus spp.*)、非洲螻蛄(*Gryllotalpa africana*)) 以及大蚊幼蟲(leatherjackets) (歐洲大蚊(European crane fly)、大蚊屬物種(*Tipula spp.*))。

【0221】 本發明還可以用於防治茅草住宅的草坪草昆蟲有害生物，包括黏蟲(諸如秋夜蛾(*fall armyworm*) 草地貪夜蛾(*Spodoptera frugiperda*))，和常見黏蟲一星黏蟲(*Pseudaletia unipuncta*)、切根蟲，象鼻蟲(尖隱喙象屬物種(*Sphenophorus spp.*))，諸如*S. venatus verstitus*和牧草長喙象(*S. parvulus*) 以及草地螟(諸如草螟屬物種(*Crambus spp.*) 和熱帶草地螟，*Herpetogramma phaeopteralis*)。

【0222】 本發明還可以用於防治在地上生活並且取食草坪草葉子的草坪草昆蟲有害生物，包括麥小蝽(諸如南方麥小蝽，南方桿長蝽(*Blissus insularis*))、狗牙根蟎(Bermudagrass mite) (*Eriophyes cynodoniensis*)、蓋氏虎尾草粉蚧(草竹粉蚧(*Antonina graminis*))、兩線沫蟬(*Prospapia bicincta*)、葉蟬、切根蟲(夜蛾(*Noctuidae*) 科)、以及麥二叉蚧。

【0223】 本發明還可以用於防治其他的草坪草有害生物，諸如在草坪中創建蟻巢的外引紅火蟻(紅火蟻(*Solenopsis invicta*))。

【0224】 在衛生領域中，根據本發明的組成物具有對抗外寄生蟲諸如硬蜱、軟蜱、疥蟎、秋蟎、蠅(叮咬和舔舐)、寄生性蠅幼蟲、虱、髮虱、鳥虱

和跳蚤的活性。

此類寄生蟲的實例係：

虱目：血虱屬物種 (*Haematopinus* spp.)、長鬣虱屬物種 (*Linognathus* spp.)、人虱屬物種 (*Pediculus* spp.) 以及陰虱屬物種 (*Phthirus* spp.)、管虱屬物種 (*Solenopotes* spp.)。

【0225】 食毛目：毛羽虱屬物種 (*Trimenopon* spp.)、短羽虱屬物種 (*Menopon* spp.)、鴨虱屬物種 (*Trinoton* spp.)、牛羽虱屬物種 (*Bovicola* spp.)、*Werneckiella*屬物種、*Lepikentron*屬物種、畜虱屬物種 (*Damalina* spp.)、鬣毛虱屬物種 (*Trichodectes* spp.) 以及貓羽虱屬物種 (*Felicola* spp.)。

【0226】 雙翅目 (*Diptera*) 及長角亞目 (*Nematocera*) 和短角亞目 (*Brachycera*)，例如伊蚊屬物種 (*Aedes* spp.)、瘧蚊屬物種 (*Anopheles* spp.)、庫蚊屬物種 (*Culex* spp.)、蚋屬物種 (*Simulium* spp.)、真蚋屬物種 (*Eusimulium* spp.)、白蛉屬物種 (*Phlebotomus* spp.)、羅蛉屬物種 (*Lutzomyia* spp.)、庫蠓屬物種 (*Culicoides* spp.)、斑虻屬物種 (*Chrysops* spp.)、駝背虻屬物種 (*Hybomitra* spp.)、黃虻屬物種 (*Atylotus* spp.)、虻屬物種 (*Tabanus* spp.)、麻虻屬物種 (*Haematopota* spp.)、*Philipomyia*屬物種、蜂虱蠅屬物種 (*Braula* spp.)、家蠅屬物種 (*Musca* spp.)、齒股蠅屬物種 (*Hydrotaea* spp.)、螻蠅屬物種 (*Stomoxys* spp.)、黑角蠅屬物種 (*Haematobia* spp.)、莫蠅屬物種 (*Morellia* spp.)、廁蠅屬物種 (*Fannia* spp.)、舌蠅屬物種 (*Glossina* spp.)、麗蠅屬物種 (*Calliphora* spp.)、綠蠅屬物種 (*Lucilia* spp.)、金蠅屬物種 (*Chrysomyia* spp.)、汙蠅屬物種 (*Wohlfahrtia* spp.)、麻蠅屬物種 (*Sarcophaga* spp.)、狂蠅屬物種 (*Oestrus* spp.)、皮蠅屬物種 (*Hypoderma* spp.)、胃蠅屬物種 (*Gasterophilus* spp.)、虱蠅屬物種 (*Hippobosca* spp.)、羊虱蠅屬物種 (*Lipoptena* spp.) 和蜉蠅屬物種 (*Melophagus* spp.)。

【0227】 蚤目 (Siphonaptera) ，例如蚤屬物種 (Pulex spp.) 、櫛頭蚤屬物種 (Ctenocephalides spp.) 、客蚤屬物種 (Xenopsylla spp.) 、角葉蚤屬物種 (Ceratophyllus spp.) 。

【0228】 異翅目 (Heteroptera) ，例如臭蟲屬物種 (Cimex spp.) 、錐鼻蟲屬物種 (Triatoma spp.) 、紅獵蝽屬物種 (Rhodnius spp.) 、錐蝽屬物種 (Panstrongylus spp.) 。

【0229】 蜚蠊目 (Blattaria) ，例如東方蜚蠊 (Blatta orientalis) 、美洲大蠊 (Periplaneta americana) 、德國小蠊 (Blattella germanica) 以及夏柏拉蟑螂屬物種 (Supella spp.) 。

【0230】 蜱蟎 (Acaria) 亞綱 (蟎科 (Acarida)) 和後氣門目 (Meta-stigmata) 和中氣門目 (Meso-stigmata) ，例如銳緣蜱屬物種 (Argas spp.) 、鈍緣蜱屬物種 (Ornithodoros spp.) 、耳蜱屬物種 (Otobius spp.) 、硬蜱屬物種 (Ixodes spp.) 、鈍眼蜱屬物種 (Amblyomma spp.) 、牛蜱屬物種 (Boophilus spp.) 、革蜱屬物種 (Dermacentor spp.) 、血蜱屬物種 (Haemophysalis spp.) 、璃眼蜱屬物種 (Hyalomma spp.) 、扇頭蜱屬物種 (Rhipicephalus spp.) 、皮刺蟎屬物種 (Dermanyssus spp.) 、刺利蟎屬物種 (Raillietia spp.) 、肺刺蟎屬物種 (Pneumonyssus spp.) 、胸刺蟎屬物種 (Sternostoma spp.) 和瓦蟎屬物種 (Varroa spp.) 。

【0231】 軸蟎目 (Actinedida) (前氣門亞目 (Prostigmata)) 和粉蟎目 (Acaridida) (無氣門亞目 (Astigmata)) ，例如蜂盾蟎屬物種 (Acarapis spp.) 、姬螯蟎屬物種 (Cheyletiella spp.) 、禽螯蟎屬物種 (Ornithocheyletia spp.) 、肉蟎屬物種 (Myobia spp.) 、瘡蟎屬物種 (Psorergates spp.) 、蠕形蟎屬物種 (Demodex spp.) 、恙蟎屬物種 (Trombicula spp.) 、犛蟎屬物種 (Listrophorus spp.) 、粉蟎屬物種 (Acarus spp.) 、食酪蟎屬物種 (Tyrophagus spp.) 、嗜木蟎屬物種

(*Caloglyphus* spp.)、頸下蟎屬物種(*Hypodectes* spp.)、翅蟎屬物種(*Pterolichus* spp.)、癢蟎屬物種(*Psoroptes* spp.)、皮蟎屬物種(*Chorioptes* spp.)、耳癢蟎屬物種(*Otodectes* spp.)、疥蟎屬物種(*Sarcoptes* spp.)、耳蟎屬物種(*Notoedres* spp.)、烏疥蟎屬物種(*Knemidocoptes* spp.)、胞蟎屬物種(*Cytodites* spp.)以及雞雛蟎屬物種(*Laminosioptes* spp.)。

【0232】 根據本發明的組成物還適用於保護諸如木材、紡織品、塑膠、膠黏劑、膠、漆料、紙和卡片、皮革、地板覆蓋物和建築的材料免受昆蟲侵襲。

【0233】 根據本發明的組成物可用於，例如，對抗以下有害生物：甲蟲，諸如北美家天牛(*Hylotrupes bajulus*)、長毛天牛(*Chlorophorus pilosis*)、傢俱竊蠹(*Anobium punctatum*)、紅毛竊蠹(*Xestobium rufovillosum*)、梳角細脈竊蠹(*Ptilinuspecticornis*)、*Dendrobium pertinex*、松芽枝竊蠹(*Ernobius mollis*)、*Priobium carpini*、褐粉蠹(*Lyctus brunneus*)、非洲粉蠹(*Lyctus africanus*)、南方粉蠹(*Lyctus planicollis*)、櫟粉蠹(*Lyctus linearis*)、柔毛粉蠹(*Lyctus pubescens*)、胸粉蠹(*Trogoxylon aequale*)、鱗毛粉蠹(*Minthesrugicollis*)、材小蠹屬物種(*Xyleborus spec.*)、條木小蠹屬物種(*Tryptodendron spec.*)、咖啡黑長蠹(*Apate monachus*)、櫟長蠹(*Bostrychus capucins*)、棕異翅長蠹(*Heterobostrychus brunneus*)、雙棘長蠹屬物種(*Sinoxylon spec.*)以及竹長蠹(*Dinoderus minutus*)，以及還有膜翅類，諸如藍黑樹蜂(*Sirex juvencus*)、大樹蜂(*Urocerus gigas*)、泰加大樹蜂(*Urocerus gigas taignus*)和*Urocerus augu*，以及白蟻類，諸如歐洲木白蟻(*Kaloterms flavicollis*)、麻頭堆砂白蟻(*Cryptoterms brevis*)、印巴結構木異白蟻(*Heteroterms indicola*)、黃胸散白蟻(*Reticulitermes flavipes*)、桑特散白蟻(*Reticulitermes santonensis*)、歐洲散白蟻(*Reticulitermes lucifugus*)、達爾文澳白蟻(*Mastoterms darwiniensis*)、內華達古白蟻(*Zootermopsis nevadensis*)與家白蟻(*Coptoterms formosanus*)，

以及蛀蟲，諸如衣魚（*Lepisma saccharina*）。

【0234】 根據本發明的化合物可以未經修飾的形式用作殺有害生物劑，但通常以多種方式使用配製佐劑（諸如載體、溶劑以及表面活性物質）將它們配製成組成物。該等配製物可以呈多種物理形式，例如，呈以下的形式：撒粉劑、凝膠、可濕性粉劑、水可分散性顆粒劑、水可分散性片劑、泡騰片劑、可乳化濃縮物、微可乳化濃縮物、水包油乳液、可流動油、水性分散體、油性分散體、懸乳液、膠囊懸浮液、可乳化顆粒劑、可溶性液體、水可溶性濃縮物（以水或水混溶性有機溶劑作為載體）、浸漬的聚合物膜或者呈例如從Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides [關於殺有害生物劑的FAO和WHO標準的發展和使用的手冊]，聯合國，第一版，第二次修訂（2010）中已知的其他形式。此類配製物可以直接使用或者在使用前進行稀釋。可以用例如水、液體肥料、微量營養素、生物有機體、油或溶劑來進行稀釋。

【0235】 可以藉由例如將活性成分與配製佐劑混合來製備該等配製物以便獲得呈精細分散固體、顆粒、溶液、分散體或乳液的形式的組成物。該等活性成分還可以與其他佐劑（諸如精細分散固體、礦物油、植物或動物來源的油、修飾的植物或動物來源的油、有機溶劑、水、表面活性物質或其組合）來一起配製。

【0236】 該等活性成分還可以被包含於非常精細的微膠囊中。微膠囊含有在多孔載體中的活性成分。這使活性成分能以受控的量值釋放（例如，緩慢釋放）到環境中。微膠囊通常具有從0.1至500微米的直徑。它們含有的活性成分的量按重量計係膠囊重量的約從25%至95%。該等活性成分可以呈整體性固體的形式、呈在固體或液體分散體中的精細顆粒的形式或呈合適的溶液的形式。包囊膜可以包括例如天然的或合成的橡膠、纖維素、苯乙烯/丁二烯共聚物、聚丙烯腈、聚丙烯酸酯、聚酯、聚醯胺、聚脲、聚胺酯或化學修飾的聚合物以及澱粉

黃原酸酯、或熟悉該項技術者已知的其他聚合物。可替代地，可以形成非常精細的微膠囊，其中活性成分以精細分散顆粒的形式包含在基礎物質的固體基質中，但該等微膠囊本身未經包裹。

【0237】 適合於製備根據本發明的組成物的配製佐劑本身係已知的。作為液體載體，可以使用：水、甲苯、二甲苯、石油醚、植物油、丙酮、甲基乙基酮、環己酮、酸酐、乙腈、乙醯苯、乙酸戊酯、2-丁酮、碳酸丁烯酯、氯苯、環己烷、環己醇、乙酸烷基酯、二丙酮醇、1,2-二氯丙烷、二乙醇胺、對-二乙基苯、二甘醇、松脂酸二乙二醇酯、二甘醇丁基醚、二甘醇乙基醚、二甘醇甲醚、*N,N*-二甲基甲醯胺、二甲基亞砷、1,4-二噁吡、二丙二醇、二丙二醇甲基醚、二苯甲酸二丙二醇酯、二丙二醇、烷基吡咯啉酮、乙酸乙酯、2-乙基己醇、碳酸乙烯酯、1,1,1-三氯乙烷、2-庚酮、 α -蒎烯、*d*-檸檬烯、乳酸乙酯、乙二醇、乙二醇丁基醚、乙二醇甲基醚、 γ -丁內酯、丙三醇、乙酸甘油酯、二乙酸甘油酯、三乙酸甘油酯、十六烷、己二醇、乙酸異戊基酯、乙酸異冰片基(*bornyl*)酯、異辛烷、異佛耳酮、異丙苯、肉豆蔻酸異丙酯、乳酸、月桂胺、亞異丙基丙酮、甲氧基丙醇、甲基異戊基酮、甲基異丁基酮、月桂酸甲酯、辛酸甲酯、油酸甲酯、二氯甲烷、間二甲苯、正己烷、正辛胺、十八烷酸、辛胺乙酸酯、油酸、油胺、鄰二甲苯、苯酚、聚乙二醇、丙酸、乳酸丙酯、碳酸丙烯酯、丙二醇、丙二醇甲基醚、對二甲苯、甲苯、磷酸三乙酯、三乙二醇、二甲苯磺酸、石蠟、礦物油、三氯乙烯、全氯乙烯、乙酸乙酯、乙酸戊酯、乙酸丁酯、丙二醇甲基醚、二乙二醇甲基醚、甲醇、乙醇、異丙醇以及更高分子量的醇，諸如戊醇、四氫呋喃醇、己醇、辛醇、乙二醇、丙二醇、甘油、*N*-甲基-2-吡咯啉酮等。

【0238】 合適的固體載體係例如滑石、二氧化鈦、葉蠟石黏土、二氧化矽、凹凸棒石黏土、矽藻土、石灰石、碳酸鈣、膨潤土、鈣蒙脫土、棉籽殼、小麥粉、大豆粉、浮石、木粉、經研磨的胡桃殼、木質素和類似物質。

【0239】 許多表面活性物質可以有利地用於固體和液體配製物兩者，尤其是可在使用前用載體稀釋的那些配製物。表面活性物質可以是陰離子的、陽離子的、非離子的或聚合的並且它們可以用作乳化劑、潤濕劑或懸浮劑或用於其他目的。典型的表面活性物質包括例如烷基硫酸酯的鹽，諸如月桂基硫酸二乙醇銨；烷基芳基磺酸酯的鹽，諸如十二烷基苯磺酸鈣；烷基酚/氧化烯加成產物，諸如乙氧基化壬基苯酚；醇/氧化烯加成產物，諸如乙氧基化十三烷醇；皂，諸如硬脂酸鈉；烷基萘磺酸酯的鹽，諸如二丁基萘磺酸鈉；磺基琥珀酸鹽的二烷基酯，諸如二(2-乙基己基)磺基琥珀酸鈉；山梨糖醇酯，諸如油酸山梨糖醇酯；季胺，諸如月桂基三甲基氯化銨；脂肪酸的聚乙二醇酯，諸如聚硬脂酸乙二醇酯；環氧乙烷和環氧丙烷的嵌段共聚物；以及磷酸單-和二-烷基酯的鹽；以及還有其他物質，例如描述於：McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual [麥卡琴清潔劑和乳化劑年鑒]，MC出版公司（MC Publishing Corp.），裡奇伍德，新澤西州（Ridgewood New Jersey）（1981）。

【0240】 可以用於殺有害生物配製物的其他佐劑包括結晶抑制劑、黏度調節劑、懸浮劑、染料、抗氧化劑、發泡劑、光吸收劑、混合助劑、消泡劑、錯合劑、中和或改變pH的物質和緩衝劑、腐蝕抑制劑、香料、潤濕劑、吸收增強劑、微量營養素、塑化劑、助流劑、潤滑劑、分散劑、增稠劑、防凍劑、殺微生物劑、以及液體和固體肥料。

【0241】 根據本發明的組成物可以包含添加劑，該添加劑包括植物或動物來源的油、礦物油、此類油的烷基酯或此類油與油衍生物的混合物。在根據本發明的組成物中的油添加劑的量總體上係基於待施用的混合物從0.01%至10%。例如，可以在噴霧混合物已經製備之後將該油添加劑以所希望的濃度添加到噴霧罐中。較佳的油添加劑包括礦物油或植物來源的油，例如菜籽油、橄欖油或葵花油；乳化的植物油；植物來源的油的烷基酯，例如甲基衍生物；或動物來

源的油，諸如魚油或牛脂。較佳的油添加劑包括C₈-C₂₂脂肪酸的烷基酯，尤其是C₁₂-C₁₈脂肪酸的甲基衍生物，例如月桂酸、棕櫚酸和油酸的甲基酯（分別為月桂酸甲酯、棕櫚酸甲酯和油酸甲酯）。許多油衍生物獲知於Compendium of Herbicide Adjuvants [除草劑佐劑綱要], 第10版, 南伊利諾大學, 2010。

【0242】 本發明組成物總體上包含按重量計從0.1%至99%，尤其是按重量計從0.1%至95%的本發明的化合物以及按重量計從1%至99.9%的配製佐劑，該配製佐劑較佳的是包含按重量計從0%至25%的表面活性物質。而商業產品可以較佳的是被配製為濃縮物，最終使用者將通常使用稀釋配製物。

【0243】 施用比率在寬範圍內變化並且取決於土壤的性質、施用方法、作物植物、待防治的有害生物、主要氣候條件、以及受施用方法、施用時間和目標作物支配的其他因素。作為一般指導，可以將化合物以從1 l/ha至2000 l/ha、尤其是從10 l/ha到1000 l/ha的比率施用。

較佳的配製物可以具有以下組成（重量%）：

可乳化濃縮物：

活性成分： 1%至95%，較佳的是60%至90%

表面活性劑： 1%至30%，較佳的是5%至20%

液體載體： 1%至80%，較佳的是1%至35%

塵劑：

活性成分： 0.1%至10%，較佳的是0.1%至5%

固體載體： 99.9%至90%，較佳的是99.9%至99%

懸浮液濃縮物：

活性成分： 5%至75%，較佳的是10%至50%

水： 94%至24%，較佳的是88%至30%

表面活性劑： 1%至40%，較佳的是2%至30%

可濕性粉劑：

活性成分： 0.5%至90%，較佳的是1%至80%

表面活性劑： 0.5%至20%，較佳的是1%至15%

固體載體： 5%至95%，較佳的是15%至90%

顆粒劑：

活性成分： 0.1%至30%，較佳的是0.1%至15%

固體載體： 99.5%至70%，較佳的是97%至85%

【0244】 以下實例進一步展示了（但不限制）本發明。

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

【0245】 將該組合與該等佐劑充分混合並且將混合物在合適的研磨機中充分研磨，得到可濕性粉劑，該可濕性粉劑可以用水稀釋以給出所希望的濃度的懸浮液。

乾種子處理用粉劑	a)	b)	c)
活性成分	25%	50%	75%
輕質礦物油	5%	5%	5%
高度分散的矽酸	5%	5%	-

高嶺土	65%	40%	-
滑石	-		20%

【0246】 將該組合與佐劑充分混合並且將該混合物在合適的研磨機中充分研磨，獲得到粉劑，該粉劑可以直接用於種子處理。

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

【0247】 可用於植物保護的具有任何所希望的稀釋度的乳液可以藉由用水稀釋從這種濃縮物獲得。

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

藉由將該組合與載體混合並且將混合物在合適的研磨機中研磨獲得即用型塵劑。此類粉劑還可以用於種子的乾拌種。

擠出機顆粒	
活性成分	15%
木質素磺酸鈉	2%

羧甲基纖維素	1%
高嶺土	82%

【0248】 將該組合與該等佐劑混合並且研磨，並且將混合物用水濕潤。將混合物擠出並且然後在空氣流中乾燥。

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

【0249】 將該精細研磨的組合在混合器中均勻地施用於用聚乙二醇濕潤的高嶺土。以這種方式獲得非塵的包衣顆粒劑。

懸浮液濃縮物

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

【0250】 將精細研磨的組合與佐劑密切混合，從而給出懸浮液濃縮物，可以藉由使用水稀釋從該濃縮物獲得任何所希望的稀釋度的懸浮液。使用此類稀釋物，可以對活的植物連同植物繁殖材料進行處理並且藉由噴霧、澆灌或浸漬保護其免受微生物侵染。

種子處理用可流動性濃縮物

活性成分	40%
丙二醇	5%
共聚物丁醇PO/EO	2%
三苯乙炔酚，具有10-20莫耳EO	2%
1,2-苯并異噻唑啉-3-酮（呈在水中的20%溶液的形式）	0.5%
單偶氮-顏料鈣鹽	5%
矽酮油（呈在水中的75%乳液的形式）	0.2%
水	45.3%

【0251】 將精細研磨的組合與佐劑密切混合，從而給出懸浮液濃縮物，可以藉由使用水稀釋從該濃縮物獲得任何所希望的稀釋度的懸浮液。使用此類稀釋物，可以對活的植物連同植物繁殖材料進行處理並且藉由噴霧、澆灌或浸漬保護其免受微生物侵染。

緩釋型膠囊懸浮液

【0252】 將28份組合與2份芳香族溶劑以及7份甲苯二異氰酸酯/聚甲烯-聚苯基異氰酸酯-混合物（8：1）進行混合。將此混合物在1.2份聚乙炔醇、0.05份消泡劑以及51.6份水的混合物中乳化直至達到所希望的粒度。向此乳液中添加在5.3份水中的2.8份1,6-二胺基己烷混合物。將混合物攪拌直至聚合反應完成。將獲得的膠囊懸浮液藉由添加0.25份增稠劑以及3份分散劑進行穩定。該膠囊懸浮液配製物含有28%的活性成分。中等膠囊直徑係8-15微米。將所得配製物作為水性懸浮液施用到種子上，在適用於此目的裝置中進行。

【0253】 配製物類型包括乳液濃縮物（EC）、懸浮液濃縮物（SC）、懸乳液（SE）、膠囊懸浮液（CS）、水可分散性顆粒劑（WG）、可乳化顆粒劑（EG）、油包水乳液（EO）、水包油乳液（EW）、微乳液（ME）、油分散體（OD）、油懸劑（OF）、油溶性液劑（OL）、可溶性濃縮物（SL）、超低容

量懸浮液 (SU)、超低容量液劑 (UL)、母藥 (TK)、可分散性濃縮物 (DC)、可濕性粉劑 (WP)、可溶性顆粒劑 (SG) 或與農業上可接受的佐劑組合的任何技術上可行的配製物。

製備實施例：

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

LCMS和GCMS方法：

方法1：

【0254】 在來自沃特斯公司 (Waters) 的質譜儀 (ZQ單四極質譜儀) 上記錄光譜，該質譜儀裝備有電灑源 (極性：正離子或負離子，毛細管電壓：3.00 kV，錐孔範圍：30-60 V，提取器：2.00 V，源溫度：150°C，去溶劑化溫度：350°C，錐孔氣體流量：0 L/h，去溶劑化氣體流量：650 L/h，質量範圍：100 Da至900 Da) 和來自沃特斯公司的Acquity UPLC：二元泵、受熱的管柱室、和二極體陣列檢測器。溶劑脫氣裝置、二元泵、受熱的管柱室、和二極體陣列檢測器。管柱：Waters UPLC HSS T3，1.8 μm，30 x 2.1 mm，溫度：60°C，DAD波長範圍 (nm)：210至500，溶劑梯度：A = 水 + 5% MeOH + 0.05% HCOOH，B = 乙腈 + 0.05% HCOOH；梯度：0 min 0% B，100%A；1.2-1.5 min 100% B；流量 (ml/min) 0.85。

方法2：

在來自沃特斯公司的質譜儀 (SQD或ZQ單四極質譜儀) 上記錄光譜，該質譜儀裝備有電灑源 (極性：正離子或負離子，毛細管電壓：3.00 kV，錐孔範圍：30-60 V，提取器：2.00 V，源溫度：150°C，去溶劑化溫度：350°C，錐孔氣體

流量：0 L/h，去溶劑化氣體流量：650 L/h，質量範圍：100 Da至900 Da）和來自沃特斯公司的Acquity UPLC：二元泵、受熱的管柱室、和二極體陣列檢測器。溶劑脫氣裝置、二元泵、受熱的管柱室、和二極體陣列檢測器。管柱：Waters UPLC HSS T3，1.8 μm ，30 x 2.1 mm，溫度：60°C，DAD波長範圍（nm）：210至500，溶劑梯度：A = 水 + 5% MeOH + 0.05% HCOOH，B = 乙腈 + 0.05% HCOOH；梯度：0 min 0% B，100% A；2.7-3.0 min 100% B；流量（ml/min）0.85。

方法3：

在來自安捷倫科技公司（Agilent Technologies）的質譜儀（6410三重四極質譜儀）上記錄光譜，該質譜儀配備有電灑源（極性：正和負極性轉換，毛細管：4.00 kV，電壓：100.00 V，氣體溫度：350°C，氣體流量：11 L/min，噴霧器氣體：45 psi，質量範圍：110-1000 Da；DAD波長範圍：210-400 nm）。管柱：KINETEX EVO C18，長度50 mm，直徑4.6 mm，粒度2.6 μm 。管柱烘箱溫度40°C。溶劑梯度：A = 含0.1%甲酸的水：乙腈（95：5 v/v）。B = 含0.1%甲酸的乙腈。梯度 = 0 min 90% A，10% B；0.9-1.8 min 0% A，100% B，2.2-2.5 min 90% A，10% B。流速1.8 mL/min。

方法4：

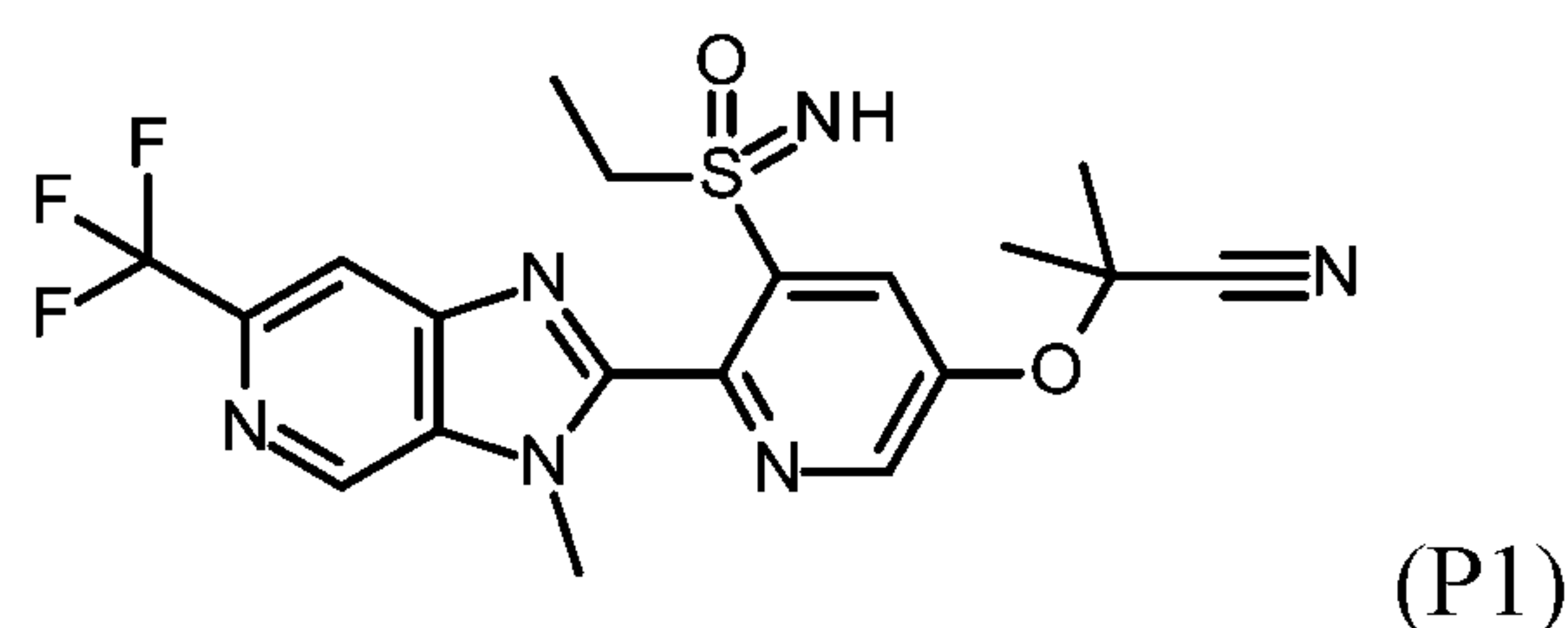
在來自沃特斯公司的質譜儀（Acquity SDS質譜儀）上記錄光譜，該質譜儀配備有電灑源（極性：正和負極性轉換，毛細管：3.00 kV，錐孔電壓：41.00 V，源溫度：150°C，去溶劑化氣體流量：1000 L/h，去溶劑化溫度：500°C，在錐孔處的氣體流量：50 L/h，質量範圍：110-800 Da；PDA波長範圍：210-400 nm。管柱：Acquity UPLC HSS T3 C18，長度30 mm，直徑2.1 mm，粒度1.8 μm 。管柱烘箱溫度40°C。溶劑梯度：A = 含0.1%甲酸的水：乙腈（95：5 v/v）。B = 含0.05%甲酸的乙腈。梯度 = 0 min 90% A，10% B；0.2 min 50% A，50% B；0.7-1.3 min 0% A，100% B；1.4-1.6 min 90% A，10% B。流速0.8 mL/min。

方法5：

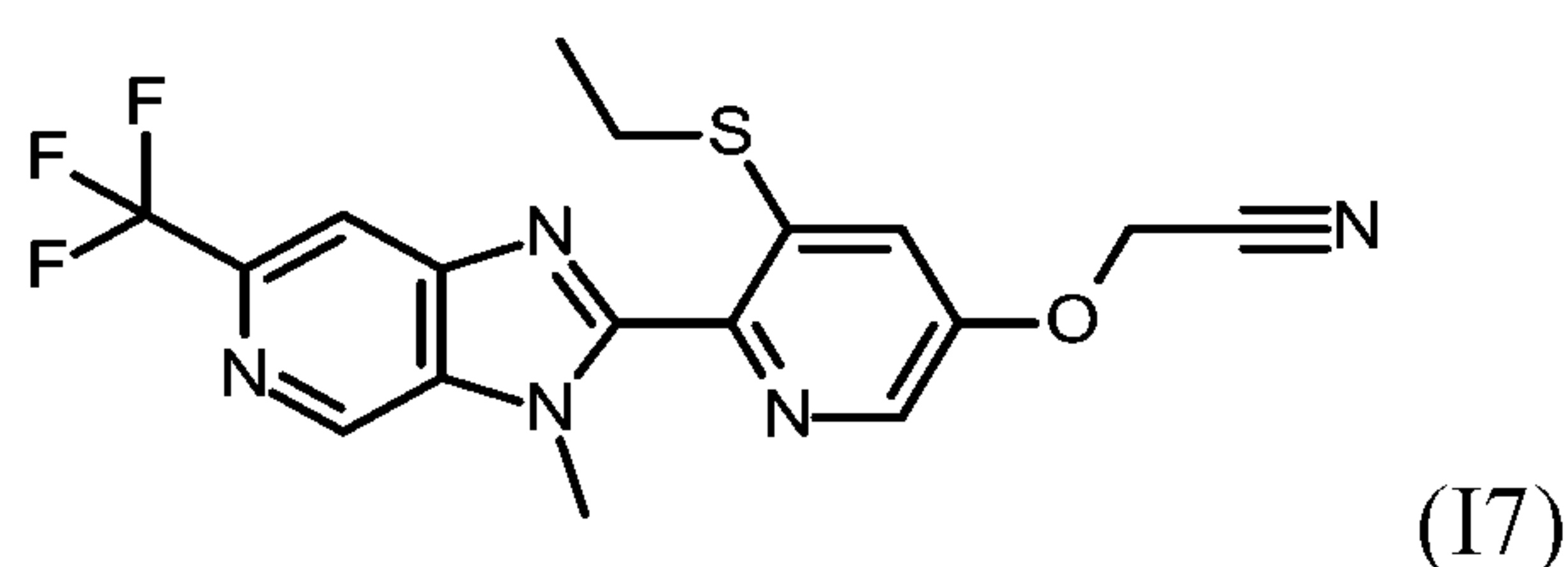
在來自沃特斯公司的質譜儀（SQ檢測器2單四極質譜儀）上記錄光譜，該質譜儀裝備有電灑源（極性：正離子或負離子，毛細管電壓：2.50 kV，錐孔電壓：41 V，提取器：3.00 V，源溫度：150°C，去溶劑化溫度：500°C，錐孔氣體流量：50 L/h，去溶劑化氣體流量：1000 L/h，質量範圍：100 Da至600 Da）和來自沃特斯公司的Acquity UPLC：四元泵、受熱的管柱室、和二極體陣列檢測器。管柱使用Waters UPLC HSS T3，1.8 μm，30 x 2.1 mm。管柱烘箱溫度40°C。DAD波長範圍（nm）：200至350。溶劑梯度：A = 水 + 5%乙腈 + 0.05% HCOOH，B = 乙腈 + 0.05% HCOOH。梯度 = 0 min 90% A，10% B；0.2 min 50% A，50% B；0.7-1.3 min 0% A，100% B；1.4-1.6 min 90% A，10% B。流速0.6 mL/min。

式 (I) 之化合物的實施例的製備：

實施例P1：2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P1）的製備



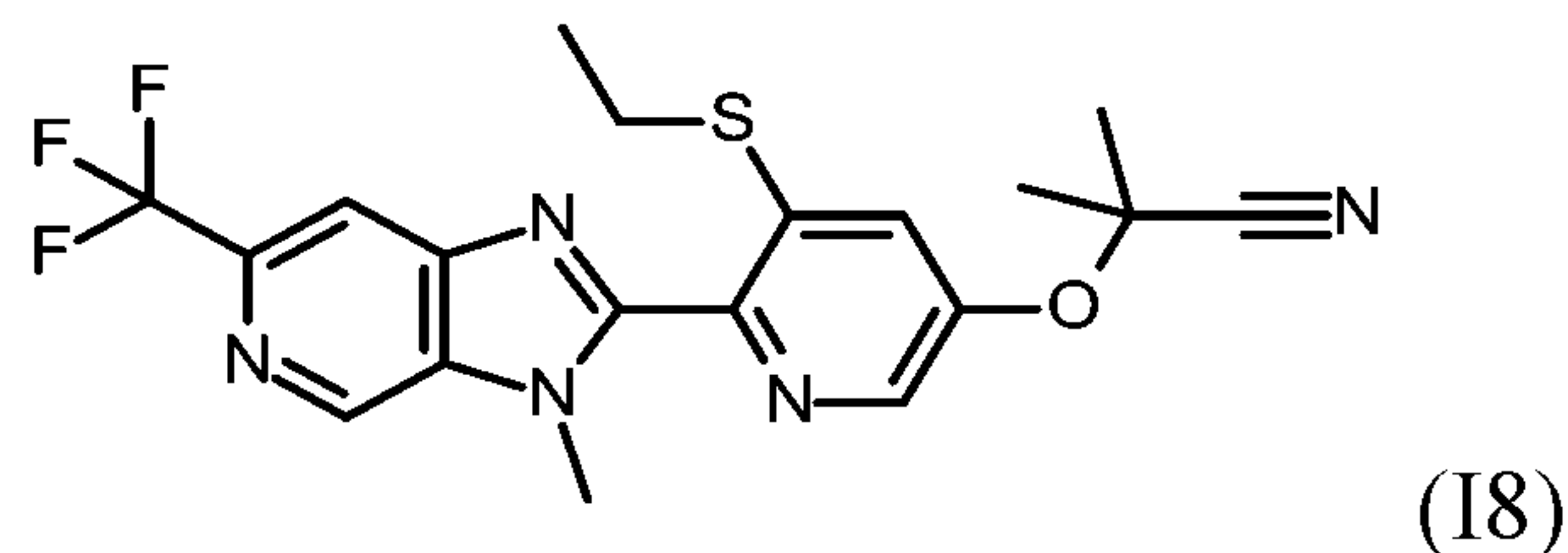
步驟1：2-[[5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]乙腈（化合物I7）的製備



【0255】 在實施例P3的步驟2中所描述的相同條件下處理5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-醇（根據WO 16096584製備）以給出所希望的化合物。

【0256】 LCMS (方法1) : m/z 394 $[M+H]^+$; 保留時間 : 0.94 min。

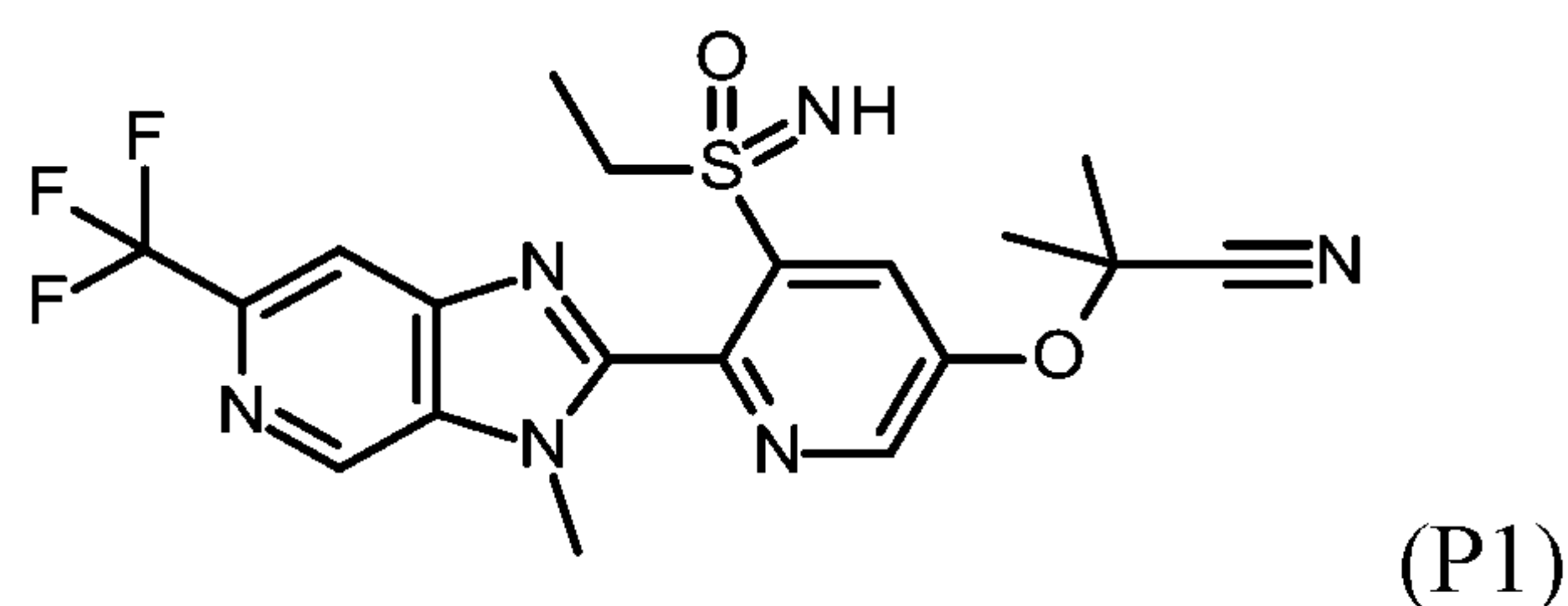
步驟2 : 2-[[5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈 (化合物I8) 的製備



【0257】 在實施例P3的步驟3中所描述的相同條件下處理2-[[5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]乙腈 (如上所描述製備的化合物I7) , 以給出2-[[5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈。

【0258】 LCMS (方法1) : m/z 422 $[M+H]^+$; 保留時間 : 1.02 min。

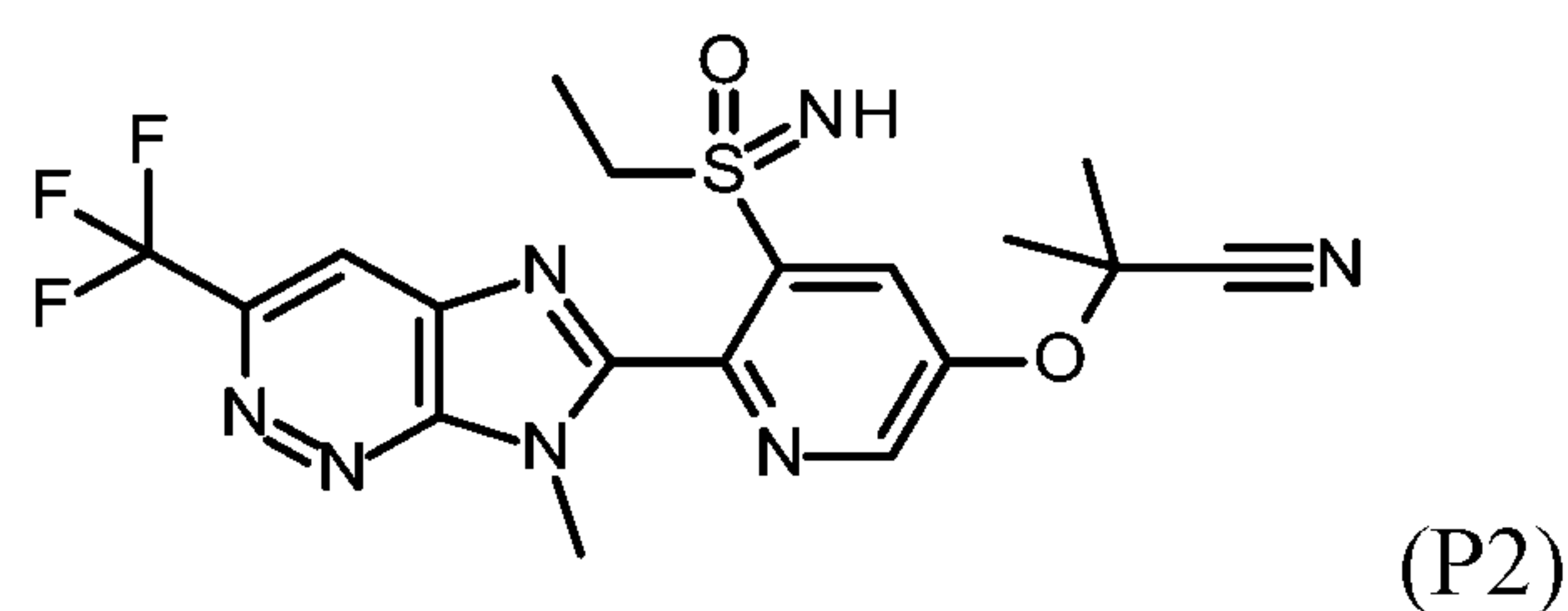
步驟3 : 2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈 (化合物P1) 的製備



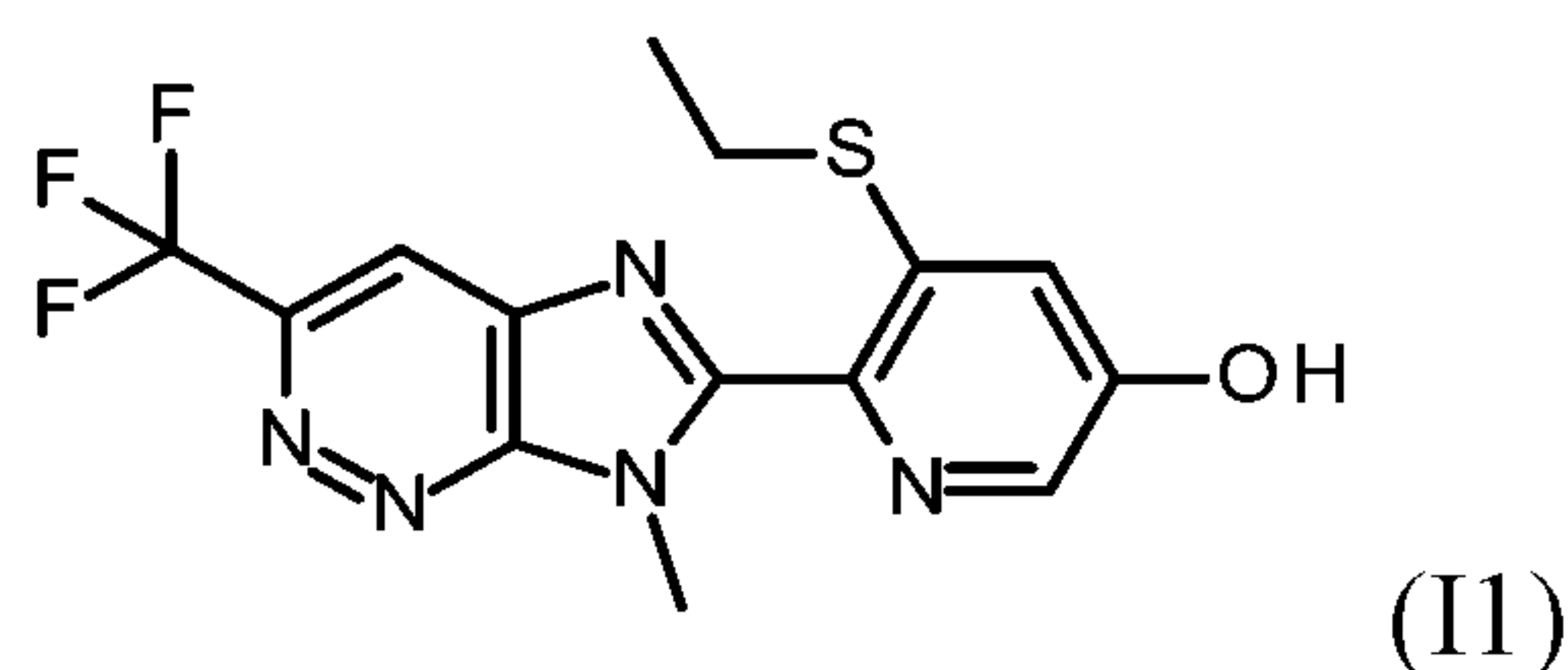
【0259】 在實施例P3的步驟4中所描述的相同條件下處理2-[[5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈 (化合物I8) 以給出所希望的化合物。

【0260】 ^1H NMR (400 MHz, 氘仿-d) δ ppm 1.40 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.93 (s, 6H) 3.89-3.74 (m, 2H) 3.90 (s, 3H) 8.12 (s, 1H) 8.40 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 8.81 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 8.99 (s, 1H)。

實施例P2 : 2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]噻吡啶-6-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈 (化合物P2) 的製備



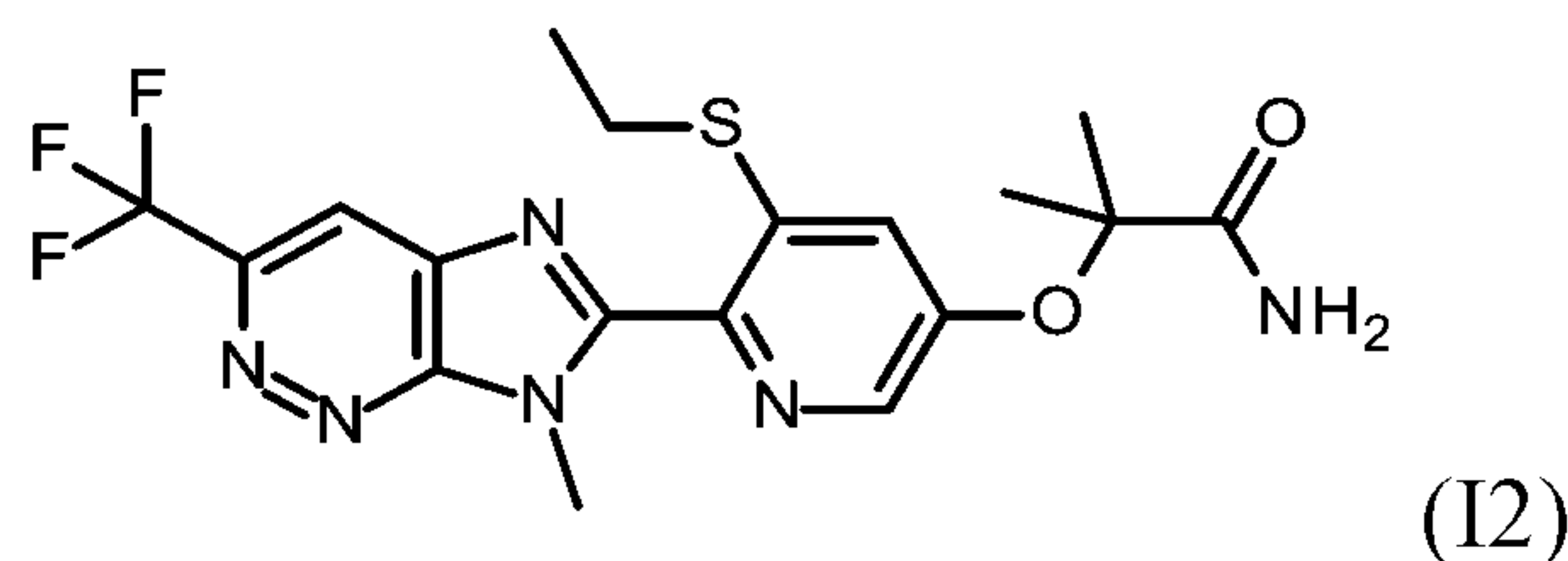
步驟1：5-乙基氫硫基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]嗒吡啶-6-基]吡啶-3-醇
(化合物I1)的製備



【0261】 將碳酸銨(19.5 g, 59.8 mmol, 2.50當量)和(E)-苯甲醛肟(3.4 mL, 31.1 mmol, 1.30當量)添加到6-(5-溴-3-乙基氫硫基-2-吡啶基)-7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]嗒吡啶(根據WO 2016059145製備)(10.0 g, 23.9 mmol)在乙腈(240 mL)中的溶液中。將所得懸浮液在50°C下攪拌42小時。冷卻至室溫後，將反應混合物在減壓下濃縮，將粗殘餘物分配在乙酸乙酯和水之間，並且藉由添加1 N鹽酸溶液將水相的pH調節至1-2。將該水相用乙酸乙酯萃取兩次，將合併的有機相經硫酸鈉乾燥，過濾並且濃縮。將粗材料藉由在矽膠上快速層析法(flash chromatography)(在二氯甲烷中的0-10%甲醇)純化，得到呈黃色固體的所希望的產物(6.90 g, 19.0 mmol)。

【0262】 ^1H NMR (400 MHz, 二甲基亞砜- d_6) δ ppm 1.25 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 2.99 (q, $J=7.34\text{Hz}$, 2H) 4.13 (s, 3H) 7.38 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H) 8.17 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H) 8.55 (s, 1H) 10.94 (s, 1H)。

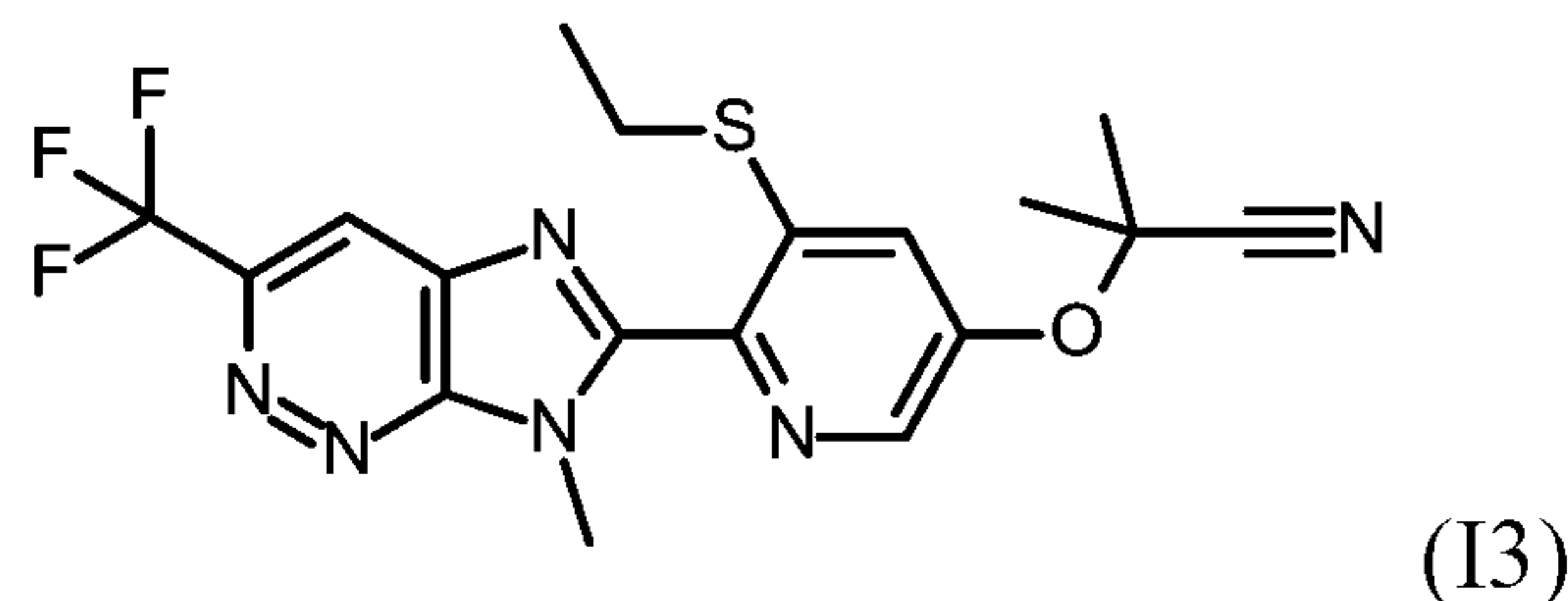
步驟2：2-[[5-乙基氫硫基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]嗒吡啶-6-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙醯胺(化合物I2)的製備



【0263】 將碳酸銨（303 mg，0.93 mmol，1.10當量）添加到5-乙基氫硫基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]嗒吡-6-基]吡啶-3-醇（如上所描述製備的化合物I1）（300 mg，0.84 mmol）在乙腈（8.4 mL）中的溶液中。將所得懸浮液攪拌5 min，然後添加2-溴-2-甲基-丙醯胺（294 mg，1.77 mmol，2.10當量），並且將反應混合物加熱並且在70°C下攪拌過夜。冷卻至室溫後，將反應混合物在減壓下濃縮，將粗殘餘物分配在乙酸乙酯和水之間，並且藉由添加1 N鹽酸溶液將水相的pH調節至1。將水相用乙酸乙酯萃取三次，並且用二氯甲烷萃取一次，將合併的有機相經硫酸鈉乾燥，過濾並且濃縮。將粗材料藉由在矽膠上快速層析法（在二氯甲烷中的0-10%甲醇）純化，得到呈黃色固體的所希望的產物（156 mg，0.56 mmol）。

【0264】 ^1H NMR (400 MHz, 二甲基亞砷-d6) δ ppm 1.26 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.60 (s, 6H) 2.96 (q, $J=7.34\text{Hz}$, 2H) 4.15 (s, 3H) 7.30 (s broad, 1H) 7.41 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H) 7.49 (m, 1H) 8.23 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H) 8.69 (s, 1H)。

步驟3：2-[[5-乙基氫硫基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]嗒吡-6-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物I3）的製備

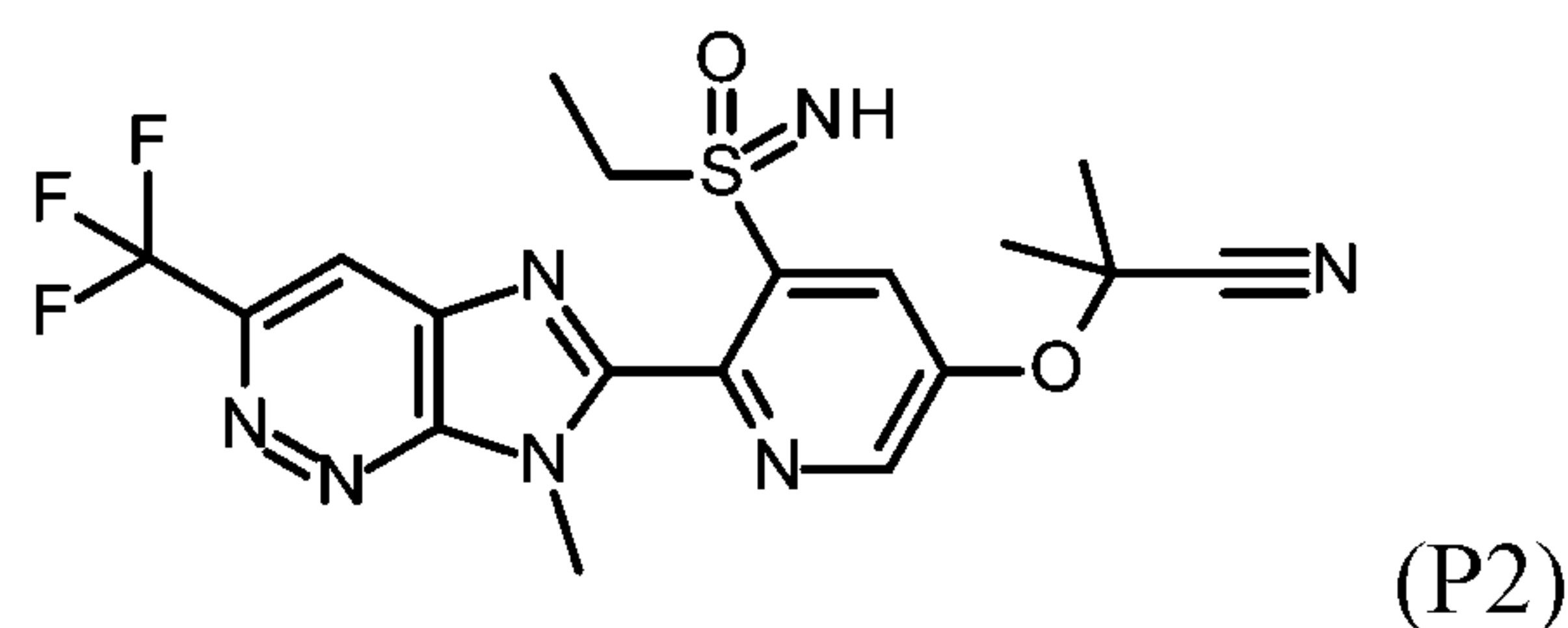


【0265】 在0°C下，將三氟乙酸酐（182 μL ，1.30 mmol，3.00當量）添加到2-[[5-乙基氫硫基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]嗒吡-6-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙醯胺（如上所描述製備的化合物I2）（317 mg，0.43 mmol）在二

氯甲烷 (4.30 mL) 和三乙胺 (243 μ L, 1.73 mmol, 4.00當量) 的溶液中。在室溫下攪拌過夜後，完成再次添加三氟乙酸酐 (182 μ L, 1.30 mmol, 3.00當量) 和三乙胺 (243 μ L, 1.73 mmol, 4.00當量)，並且將反應混合物在室溫下另外攪拌2小時。藉由添加甲醇，然後添加飽和碳酸氫鈉溶液小心地淬滅反應混合物。將水相用二氯甲烷萃取兩次，將合併的有機層經硫酸鈉乾燥，過濾並且濃縮。將粗材料藉由在矽膠上快速層析法 (在二氯甲烷中的0-10%甲醇) 純化，以給出呈黃色油狀物的所希望的產物 (156 mg, 0.37 mmol)。

【0266】 ^1H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.42 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.88 (s, 6H) 3.03 (q, $J=7.34\text{Hz}$, 2H) 4.31 (s, 3H) 7.72 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 8.26 (s, 1H) 8.39 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H)。

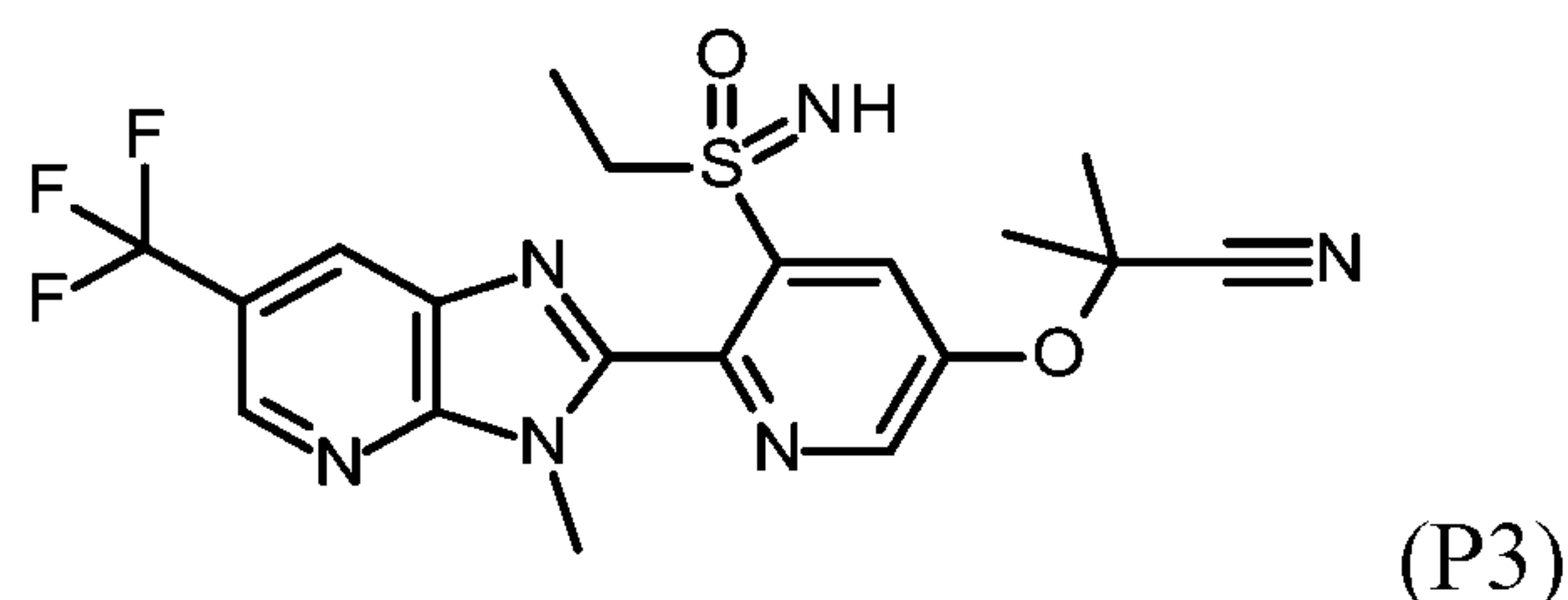
步驟4：2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]嗒啉-6-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈 (化合物P2) 的製備



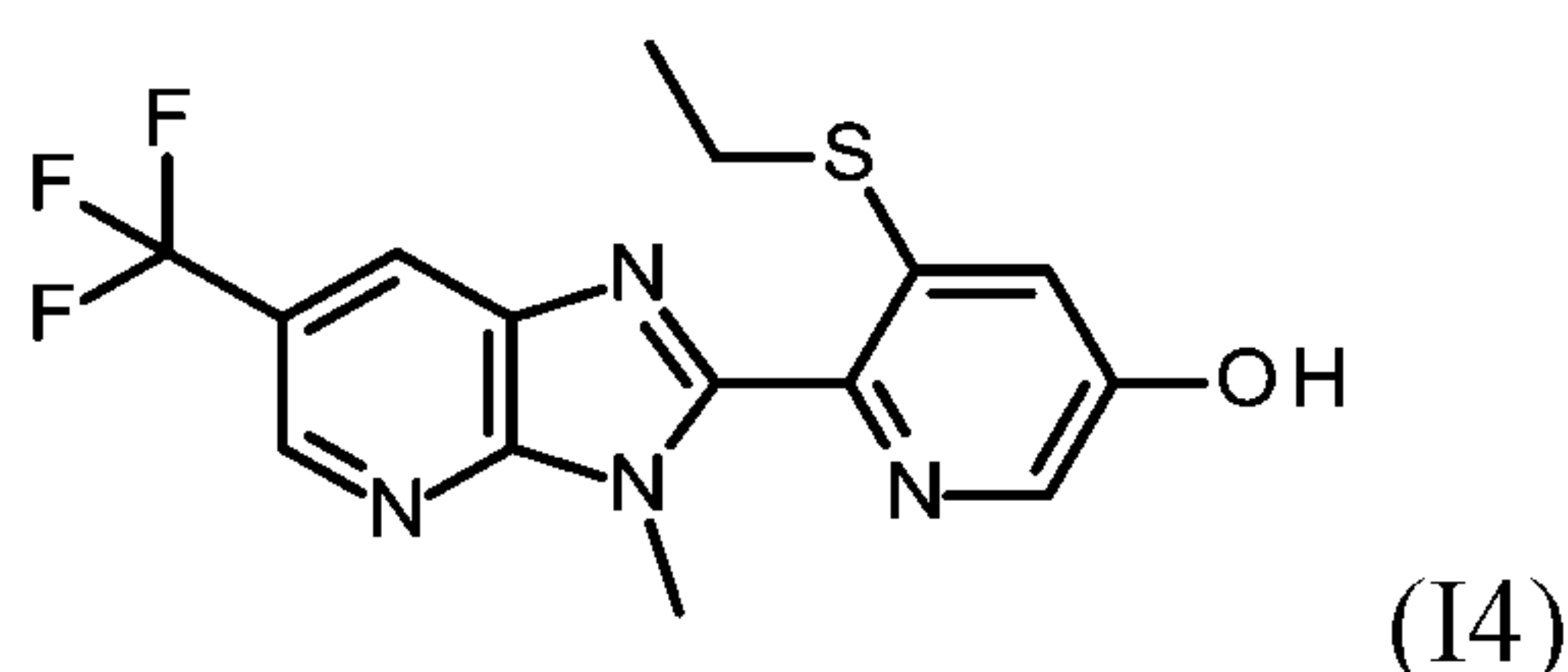
【0267】 將二乙醯氧基碘苯 (257 mg, 0.78 mmol, 3.00當量) 和胺基甲酸銨 (52 mg, 0.65 mmol, 2.50當量) 添加到2-[[5-乙基氫硫基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]嗒啉-6-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈 (如上所描述製備的化合物I3) (110 mg, 0.26 mmol) 在甲醇 (0.78 mL) 中的懸浮液中。在室溫下攪拌30 min後，將反應混合物用冰水、然後用硫代硫酸鈉飽和水溶液淬滅。控制水相中的過氧化物的任何存在，然後用乙酸乙酯萃取兩次。將合併的有機層用鹽水洗滌，經無水硫酸鈉乾燥，過濾並且在真空下濃縮。將粗產物藉由在矽膠上快速層析法 (在二氯甲烷中的0-15%甲醇) 純化，以得到呈白色固體的所希望的化合物 (98 mg, 0.22 mmol)。

【0268】 ^1H NMR (400 MHz, 二甲基亞砜- d_6) δ ppm 1.18 (t, $J=7.52\text{Hz}$, 3H) 1.60 (s, 6H) 3.69-3.49 (m, 2H) 3.91 (s, 3H) 4.63 (s, 1H) 8.30 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 8.74 (s, 1H) 8.93 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H)。

實施例P3：2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P3）的製備



步驟1：5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-3-醇（化合物I4）的製備

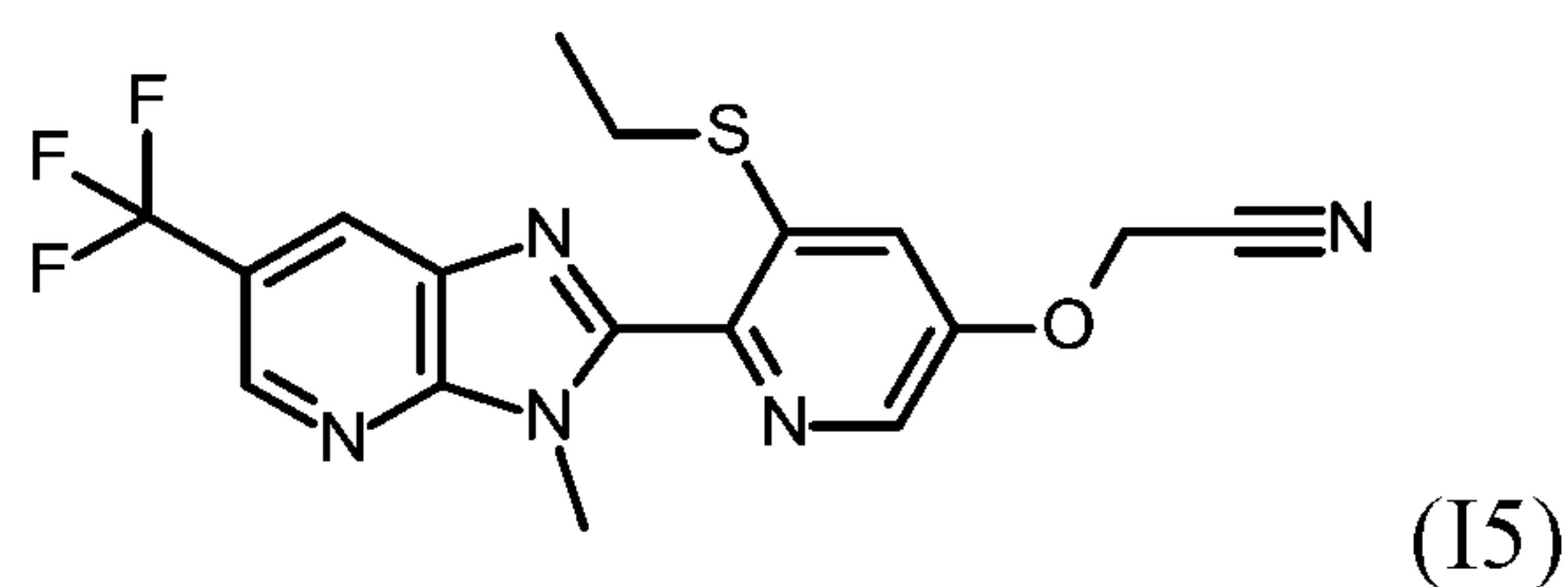


【0269】 將碳酸銨（12.9 g，39.5 mmol，2.20 當量）和(E)-苯甲醛肟（2.55 mL，23.4 mmol，1.30 當量）添加到2-(5-溴-3-乙基氫硫基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶（CAS 1421955-74-9）（7.50 g，18.0 mmol）在N,N-二甲基甲醯胺（36 mL）中的溶液中。將所得懸浮液在80°C下攪拌過夜。冷卻至室溫後，將反應混合物用二氯甲烷（500 mL）稀釋，將有機相用水（3*200 mL）洗滌，並且藉由添加1 N鹽酸溶液將水相的pH調節至1-2。將水相用二氯甲烷（5*300 mL）萃取，將合併的有機相經硫酸鈉乾燥，過濾並且濃縮。將粗材料藉由在矽膠上快速層析法（在環己烷中的乙酸乙酯）純化，得到所希望的產物（5.80 g，16.4 mmol）。

【0270】 LCMS（方法1）：m/z 355 [M+H]⁺；保留時間：0.94 min。

步驟2：2-[[5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-3-吡啶

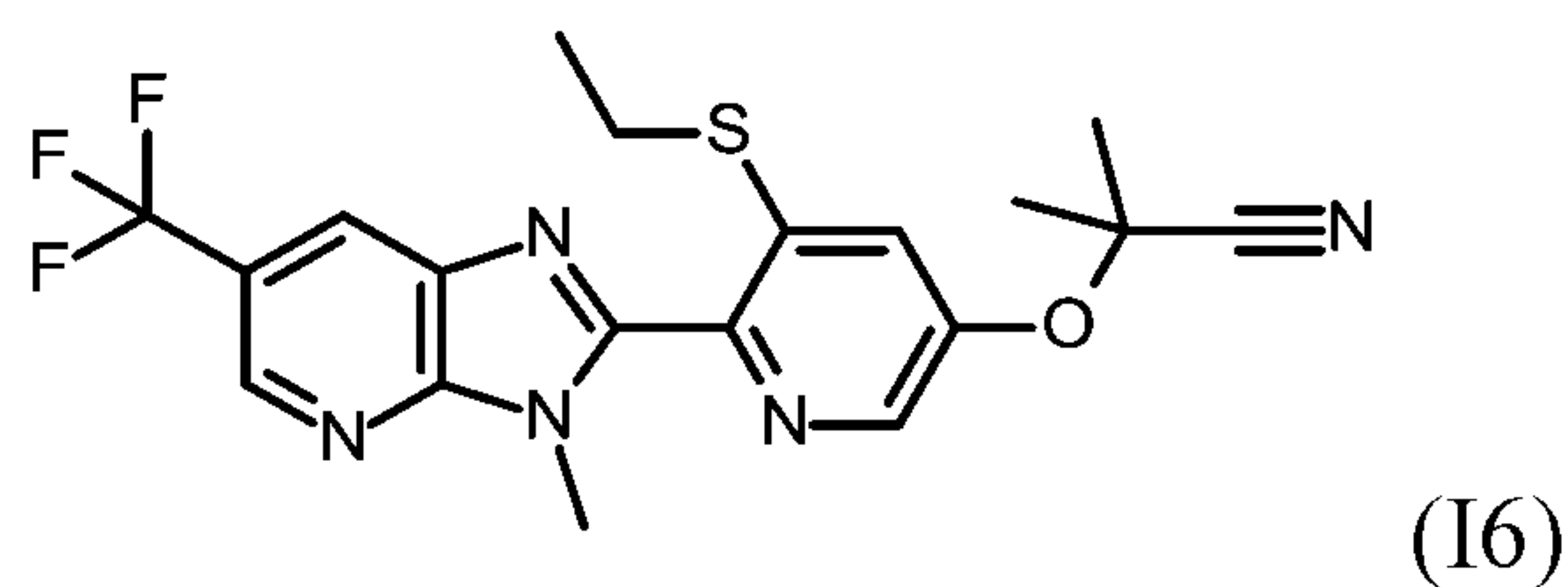
基]氧基]乙腈（化合物I5）的製備



【0271】 在室溫下，在氬氣下，將碳酸鉀（1.21 g，8.47 mmol，1.50當量）然後將溴乙腈（608 μ L，8.47 mmol，1.50當量）添加到5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-3-醇（如上所描述製備的化合物I4）（2.00 g，5.64 mmol）在N,N-二甲基甲醯胺（40 mL）中的溶液中。攪拌5小時後，將反應混合物傾倒在水（300 mL）上，並且將水相用乙酸乙酯（300 mL）萃取兩次。將合併的有機相用水（3*200 mL）洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並且濃縮。將粗材料藉由在矽膠上層析法（在環己烷中的乙酸乙酯）純化，以給出呈黃色固體的所希望的化合物（2.08 g，5.28 mmol）。

【0272】 LCMS（方法1）： m/z 394 $[M+H]^+$ ；保留時間：1.01 min。

步驟3：2-[[5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物I6）的製備

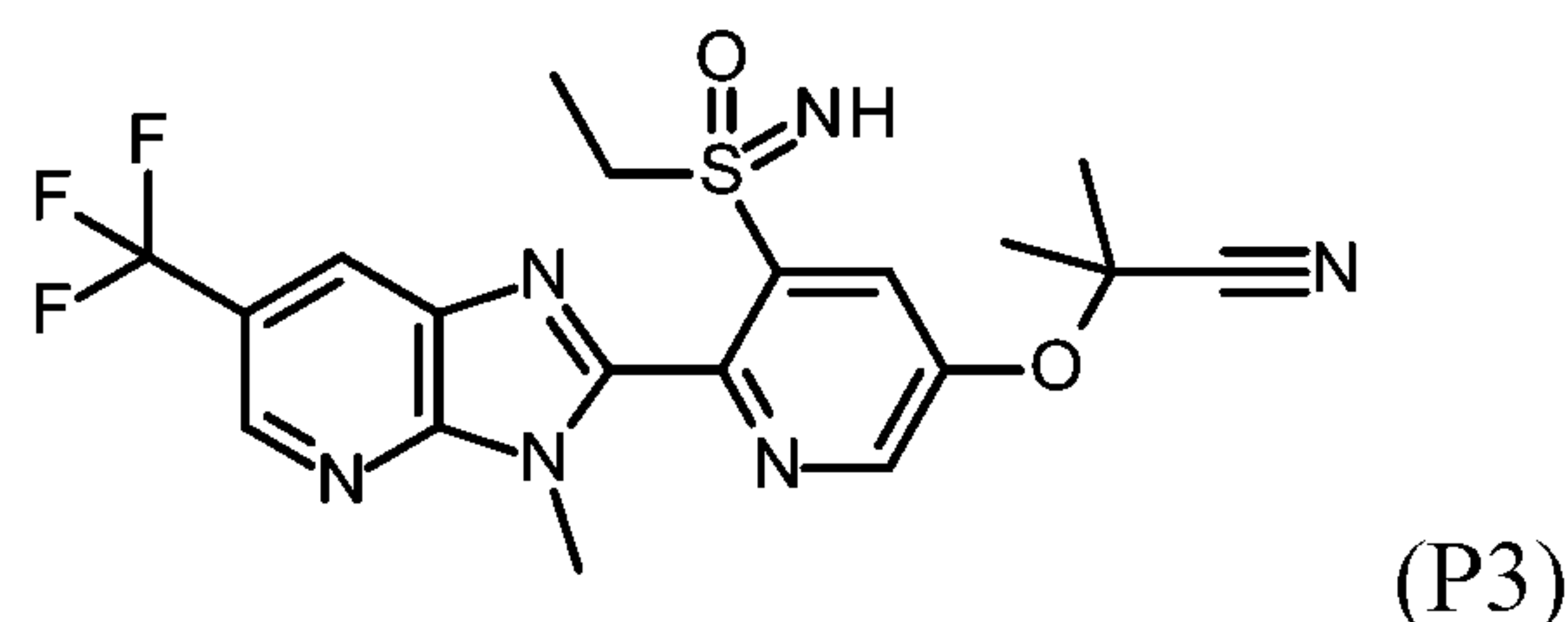


【0273】 將在四氫呋喃（15.8 mL，15.8 mmol，3.00當量）中的1 M六甲基二矽氮烷鋰溶液藉由滴液漏斗逐滴添加到2-[[5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]乙腈（如上所描述製備的化合物I5）（2.07 g，5.26 mmol）和碘甲烷（1.31 mL，21.0 mmol，4.00當量）在於0°C冷卻的四氫呋喃（32 mL）中的溶液中。添加完成後，將反應混合物用冰浴攪拌1小時，然後溫熱至室溫並且攪拌過夜。藉由在0°C（50 mL）下傾倒在飽和碳酸氫鈉水溶液上來淬滅反應混合物。將水相用乙酸乙酯萃取（2*50 mL）。將合併的

有機相經硫酸鈉乾燥，過濾並且蒸發。將粗材料藉由在矽膠上快速層析法（在環己烷中的乙酸乙酯）純化，以得到所希望的化合物（700 mg，1.66 mmol）。

【0274】 LCMS（方法1）： m/z 422 $[M+H]^+$ ；保留時間：1.11 min。

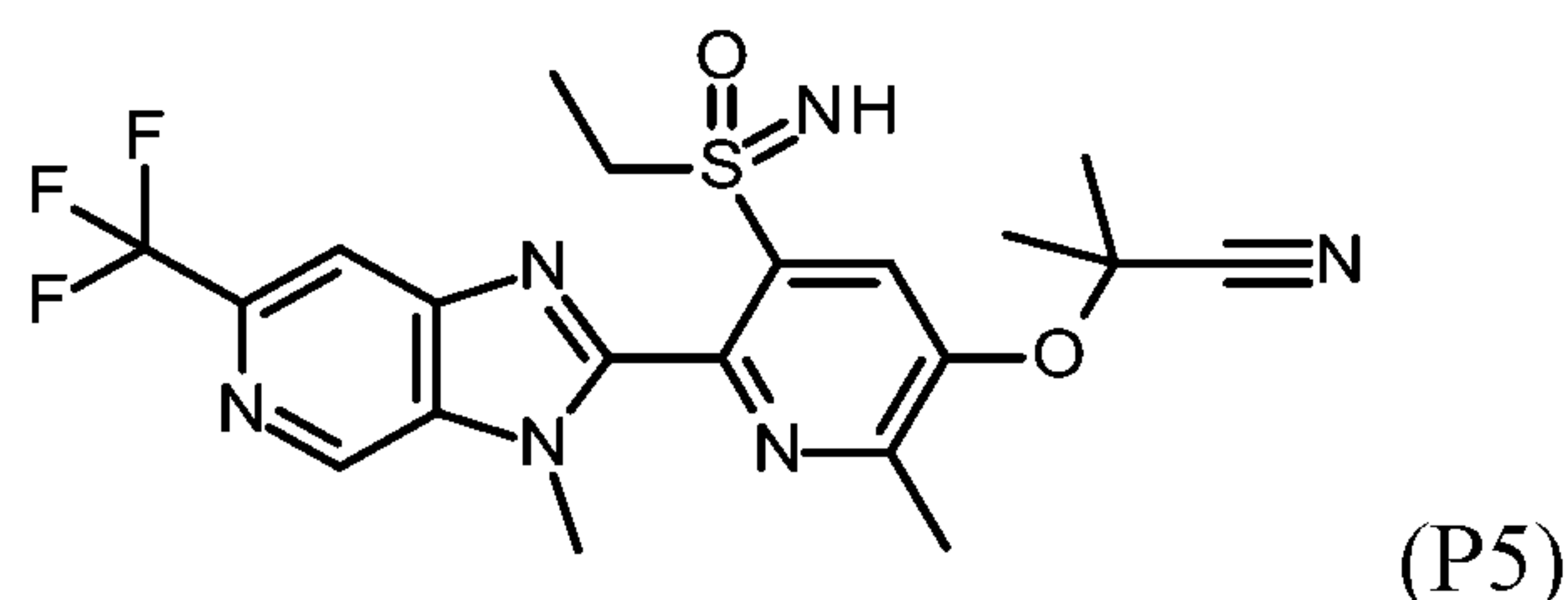
步驟4：2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P3）的製備



【0275】 將2-[[5-乙基磺基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（如上所描述製備的化合物I6）（400 mg，0.95 mmol）在甲醇（2.85 mL）中的溶液添加到二乙醯氧基碘苯（917 mg，2.85 mmol，3.00當量）和胺基甲酸銨（185 mg，2.37 mmol，2.50當量）的固體混合物中。在室溫下攪拌過夜後，將反應混合物用硫代硫酸鈉飽和水溶液淬滅。控制水相中的過氧化物的任何存在，然後用乙酸乙酯萃取兩次。將合併的有機層經無水硫酸鈉乾燥，過濾並且在真空下濃縮。將粗產物藉由在矽膠上快速層析法（在環己烷中的乙酸乙酯）純化，以得到呈黃色固體的所希望的化合物（295 mg，0.65 mmol）。

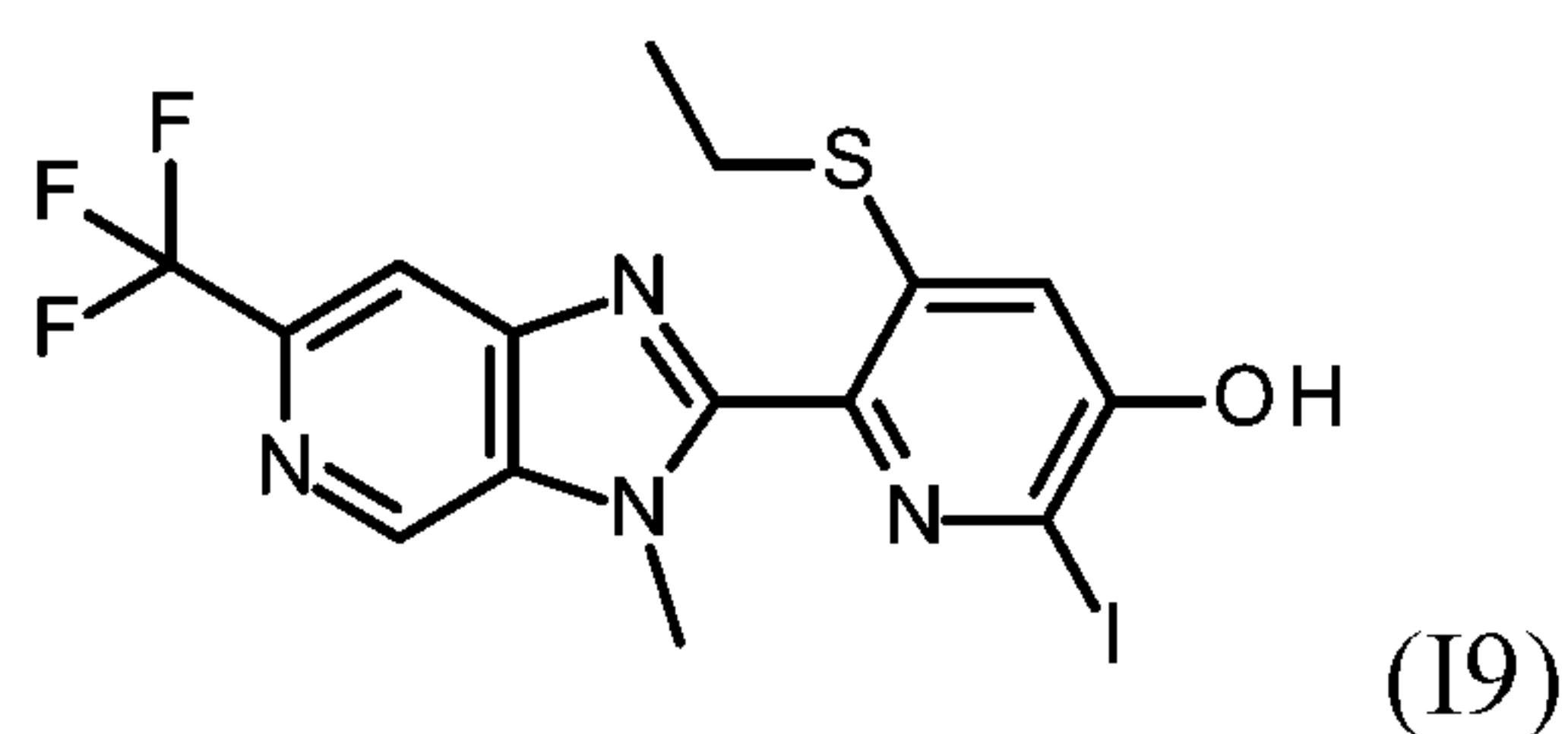
【0276】 LCMS（方法1）： m/z 453 $[M+H]^+$ ；保留時間：0.93 min。

實施例P5：2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P5）的製備



步驟1：5-乙基磺基-2-碘-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶

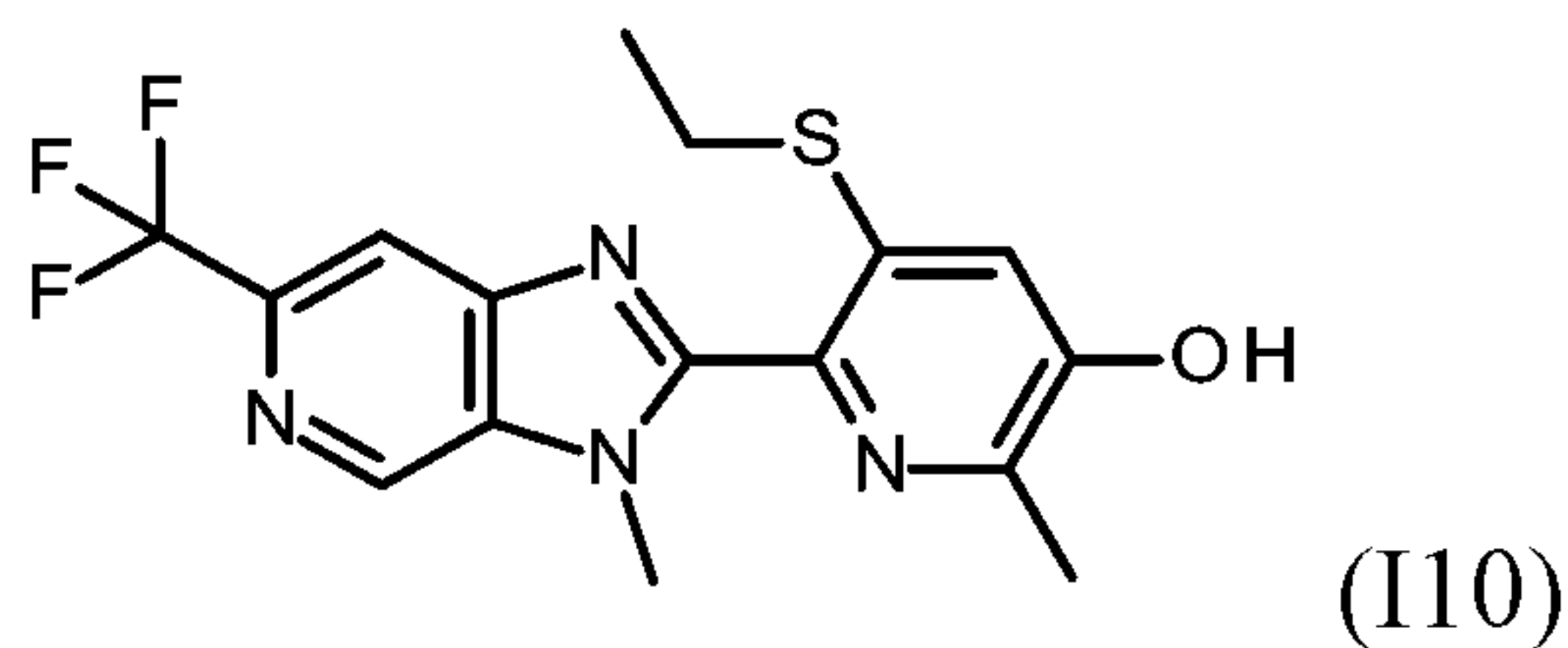
-3-醇（化合物I9）的製備



【0277】 在室溫下，在氫氣下，將分子碘（6.95 g，27.4 mmol，1.20當量）分批添加到5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-醇（根據WO 16096584製備）（8.08 g，22.8 mmol）和碳酸鈉（5.07 g，47.9 mmol，2.10當量）在水（68 mL）和乙腈（68 mL）中的混合物中。攪拌5小時後，將反應混合物用20% w/w的硫代硫酸鈉水溶液淬滅，控制水相中的過氧化物的存在，並且然後用乙酸乙酯萃取。將合併的有機相用鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並且濃縮。可以將粗材料藉由在矽膠上快速層析法（在環己烷中的乙酸乙酯）純化，以提供所希望的產物，但是也可以直接用於下一步驟。

【0278】 LCMS（方法1）： m/z 481 $[M+H]^+$ ；保留時間：0.96 min。

步驟2：5-乙基氫硫基-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-醇（化合物I10）的製備

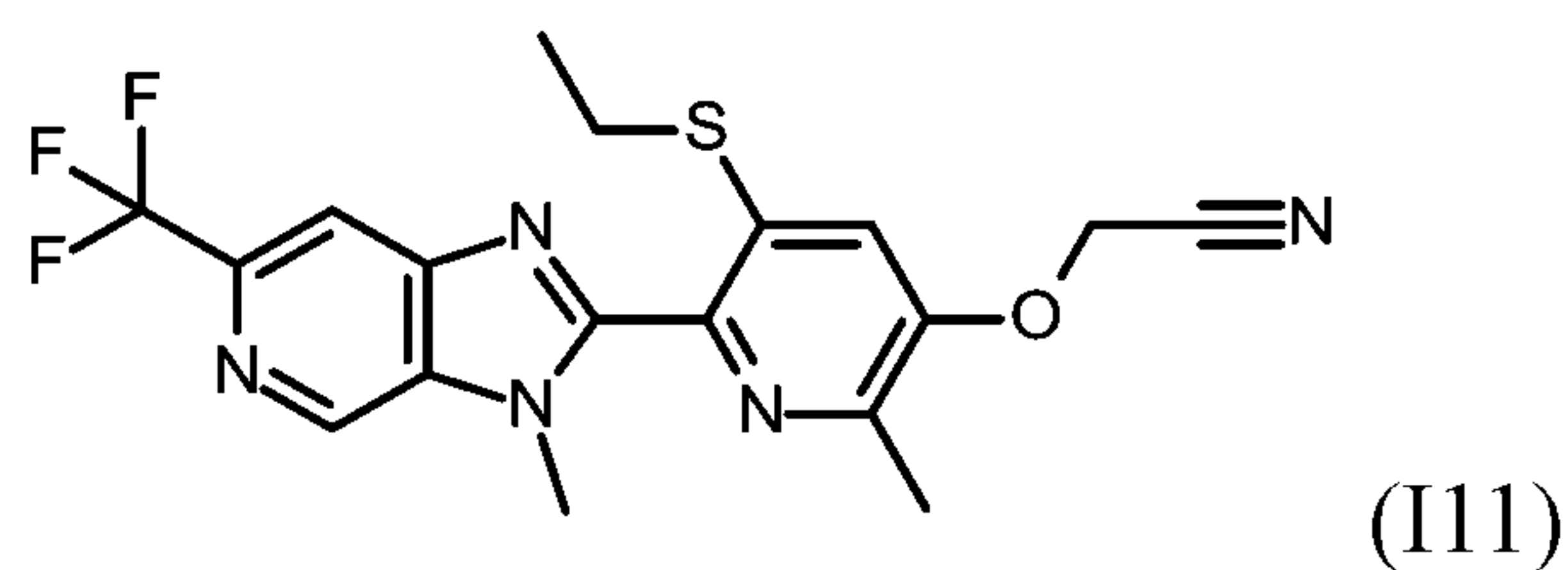


【0279】 在室溫下，在氫氣下，將三甲基硼氧六環（6.63 mL，46.7 mmol，2.50當量）添加到5-乙基氫硫基-2-碘-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-醇（如上所描述製備的化合物I9）（9.76 g，18.7 mmol）、碳酸鉀（8.16 g，56.1 mmol，3.00當量）和[1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵]二氧化鈮(II)二氯甲烷錯合物（3.85 g，4.67 mmol，0.25當量）在1,4-二噁咁（140 mL）中的混合物中。將反應混合物加熱至100°C並且攪拌3小時。冷卻至室溫後，將粗混合物經矽藻

土墊過濾，用乙酸乙酯洗滌。將濾液在真空下濃縮以給出12.5 g粗產物，將其藉由在矽膠上快速層析法(在環己烷中的乙酸乙酯)純化以給出所希望的產物(2.77 g, 7.52 mmol)。

【0280】 LCMS (方法1) : m/z 369 $[M+H]^+$; 保留時間 : 0.87 min。

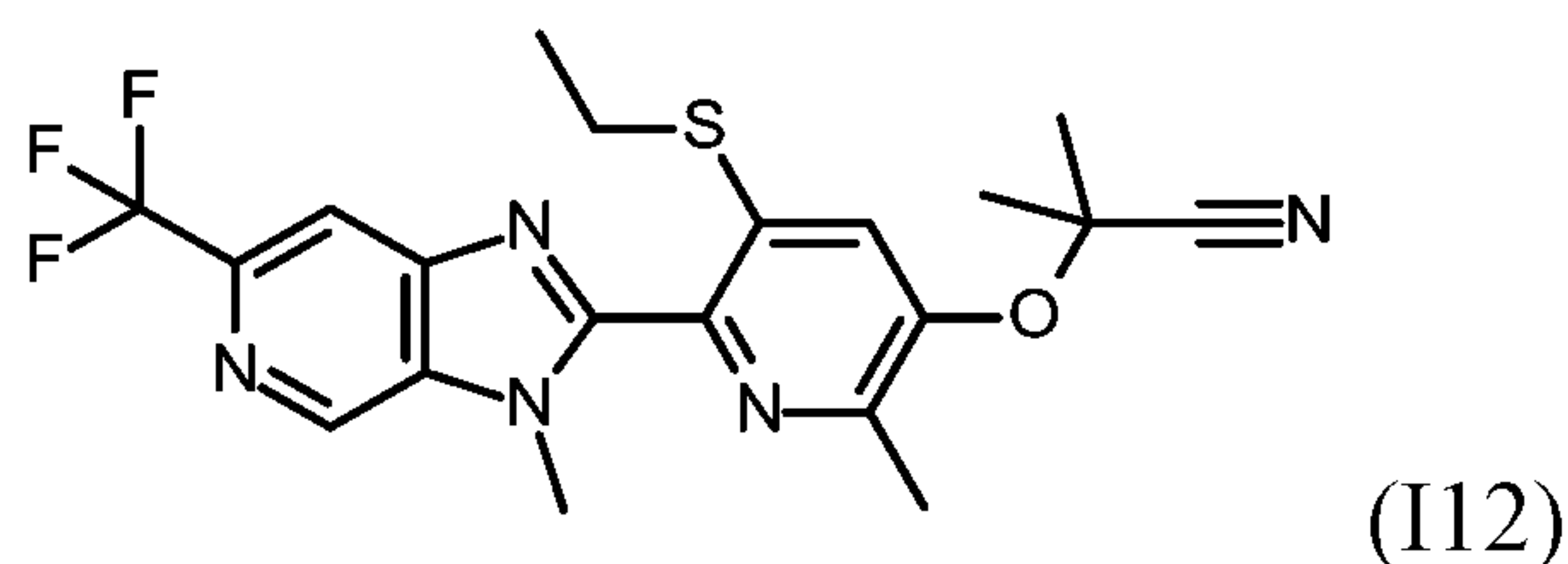
步驟3 : 2-[[5-乙基氫硫基-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]乙腈 (化合物I11) 的製備



【0281】 在室溫下，在氫氣下，將碳酸鉀 (1.45 g, 10.2 mmol, 1.50當量) 然後將溴乙腈 (731 μ L, 10.2 mmol, 1.50當量) 添加到5-乙基氫硫基-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-醇 (如上所描述製備的化合物I10) (2.50 g, 6.79 mmol) 在N,N-二甲基甲醯胺 (34 mL) 中的溶液中。攪拌2小時後，將反應混合物傾倒在水上，並且將水相用乙酸乙酯萃取兩次。將合併的有機相用鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並且濃縮。粗材料不經進一步純化直接使用。

【0282】 LCMS (方法1) : m/z 408 $[M+H]^+$; 保留時間 : 0.96 min。

步驟4 : 2-[[5-乙基氫硫基-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈 (化合物I12) 的製備

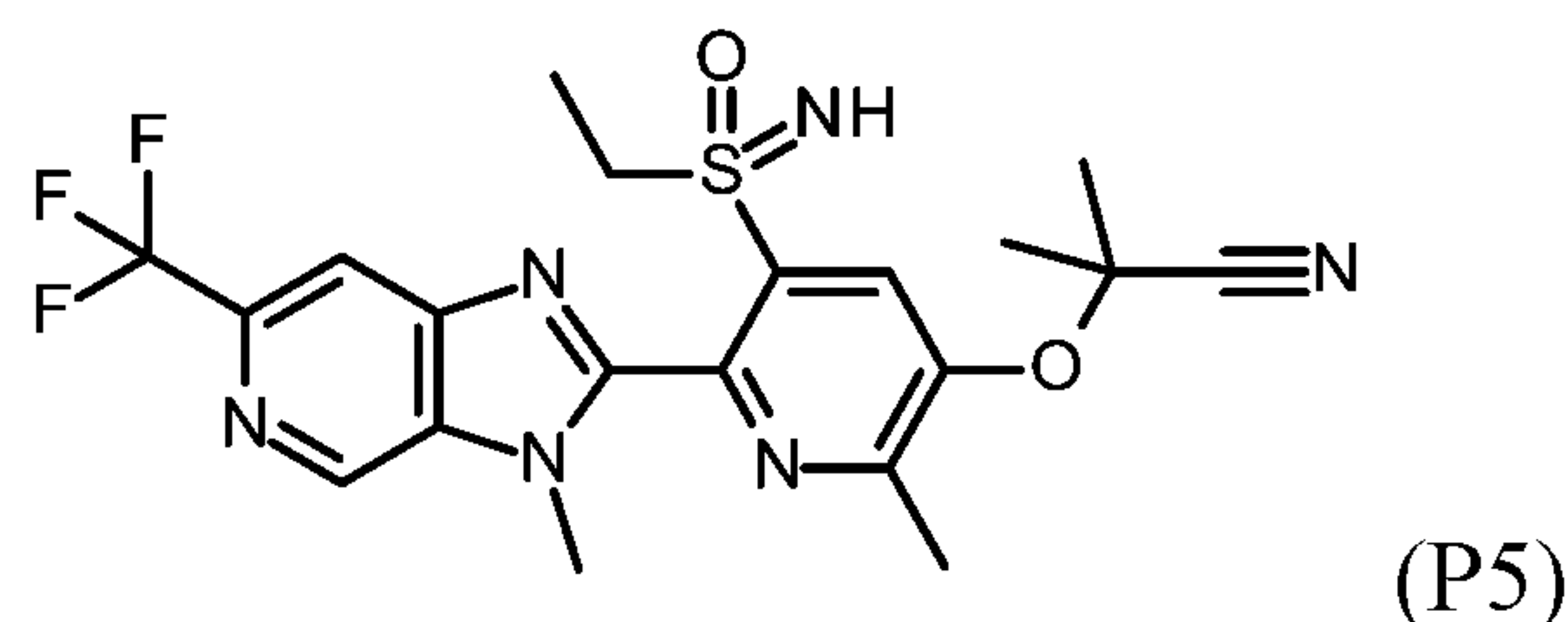


【0283】 將在四氫呋喃 (18.8 mL, 18.8 mmol, 3.00當量) 中的1 M六甲基二矽氮烷鋰溶液藉由滴液漏斗逐滴添加到2-[[5-乙基氫硫基-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]乙腈(如上所描述製備的化

合物I11) (2.55 g, 6.26 mmol) 和碘甲烷 (1.17 mL, 18.8 mmol, 3.00當量) 在於0°C冷卻的四氫呋喃 (12.5 mL) 中的溶液中。添加完成後，將反應混合物緩慢加熱至室溫，並且攪拌2.5小時。藉由傾倒在飽和碳酸氫鈉水溶液上使反應混合物淬滅，將水相用乙酸乙酯萃取。將合併的有機相經硫酸鈉乾燥，過濾並且蒸發。將粗材料藉由在矽膠上快速層析法 (在環己烷中的乙酸乙酯) 純化，以得到所希望的化合物。

【0284】 LCMS (方法1) : m/z 436 [M+H]⁺; 保留時間: 1.06 min。

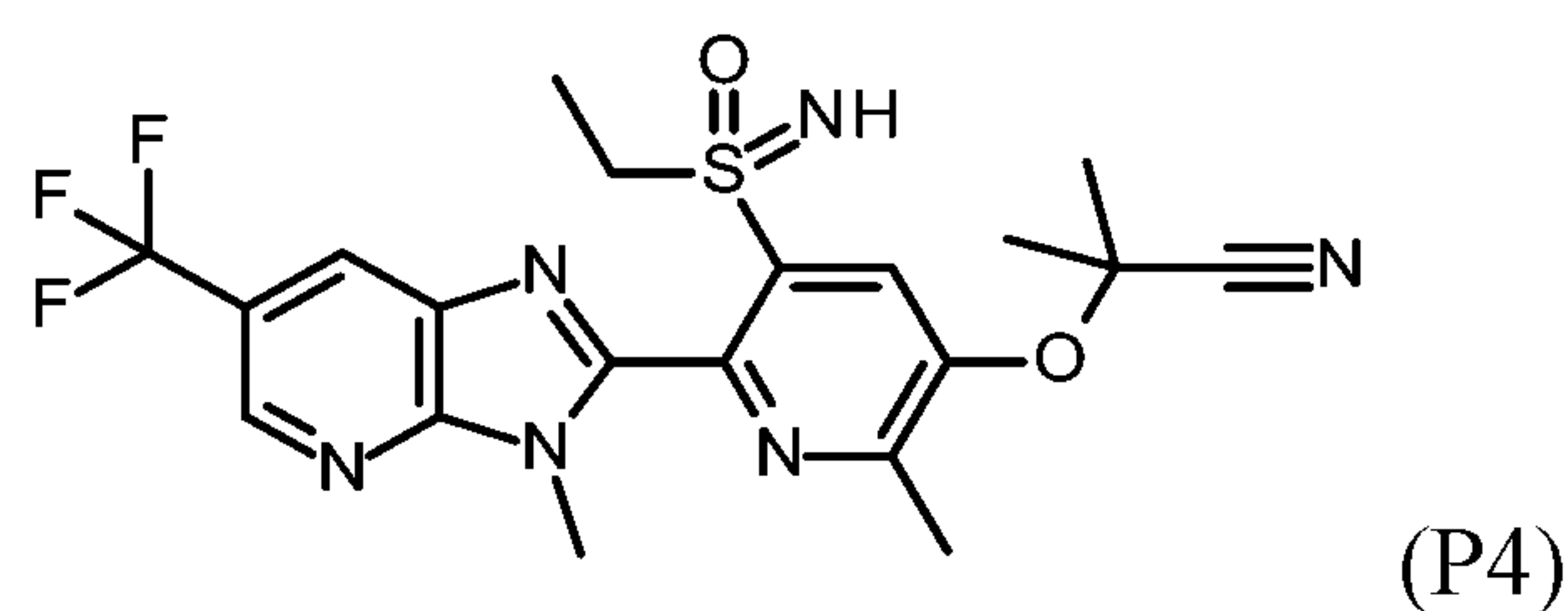
步驟5: 2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈 (化合物P5) 的製備



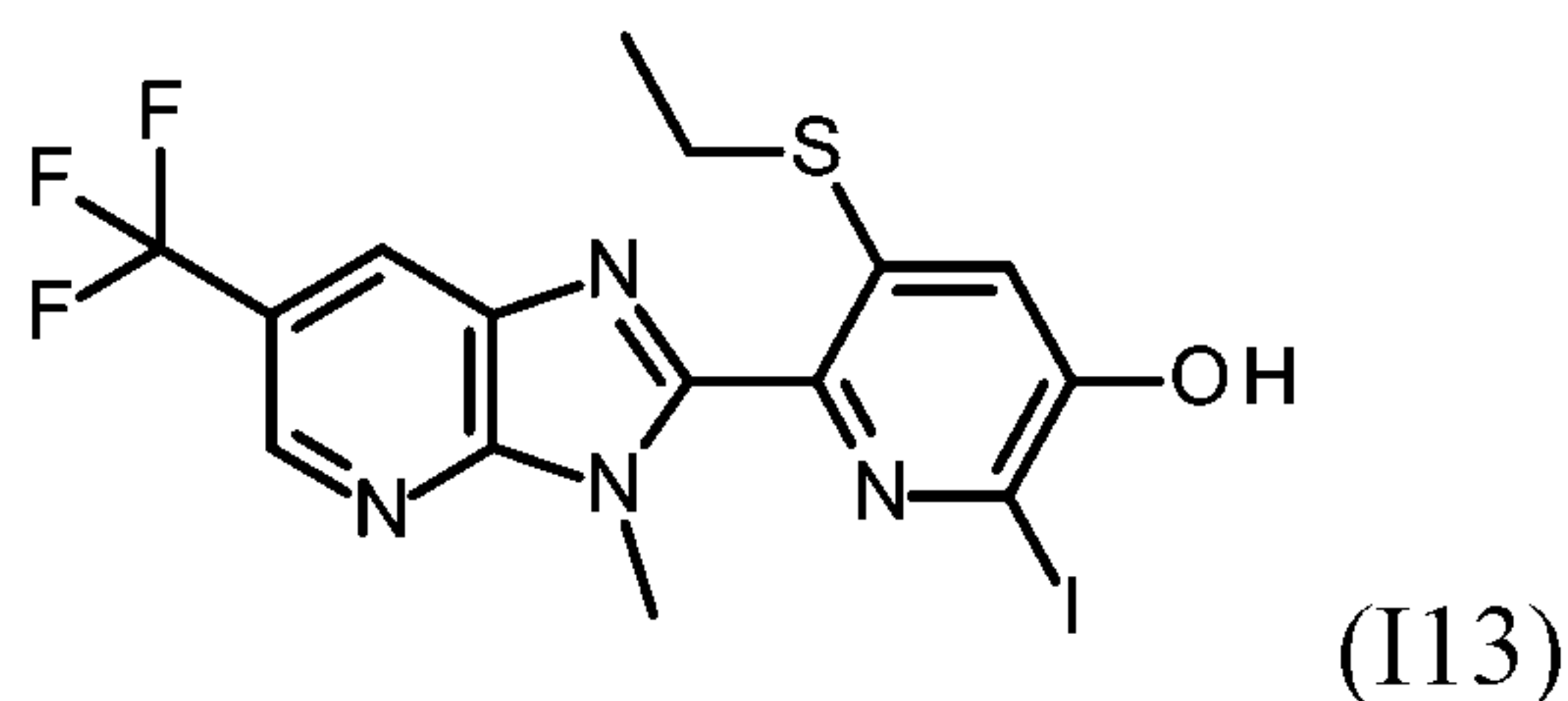
【0285】 將2-[[5-乙基氫硫基-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈 (如上所描述製備的化合物I12) (800 mg, 1.34 mmol) 在甲醇 (6.89 mL) 中的溶液添加到二乙醯氧基碘苯 (1.36 g, 4.13 mmol, 3.00當量) 和胺基甲酸銨 (274 mg, 3.44 mmol, 2.50當量) 的固體混合物中。在室溫下攪拌2小時後，將反應混合物用硫代硫酸鈉飽和水溶液淬滅。控制水相中的過氧化物的任何存在，然後用乙酸乙酯萃取兩次。將合併的有機層用鹽水洗滌，經無水硫酸鈉乾燥，過濾並且在真空下濃縮。將粗產物藉由在矽膠上快速層析法 (在環己烷中的乙酸乙酯) 純化，然後藉由反相層析法 (水/乙腈) 進行第二純化以得到所希望的化合物 (186 mg, 0.40 mmol)。

【0286】 LCMS (方法1) : m/z 467 [M+H]⁺; 保留時間: 0.91 min。

實施例P4: 2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈 (化合物P4) 的製備



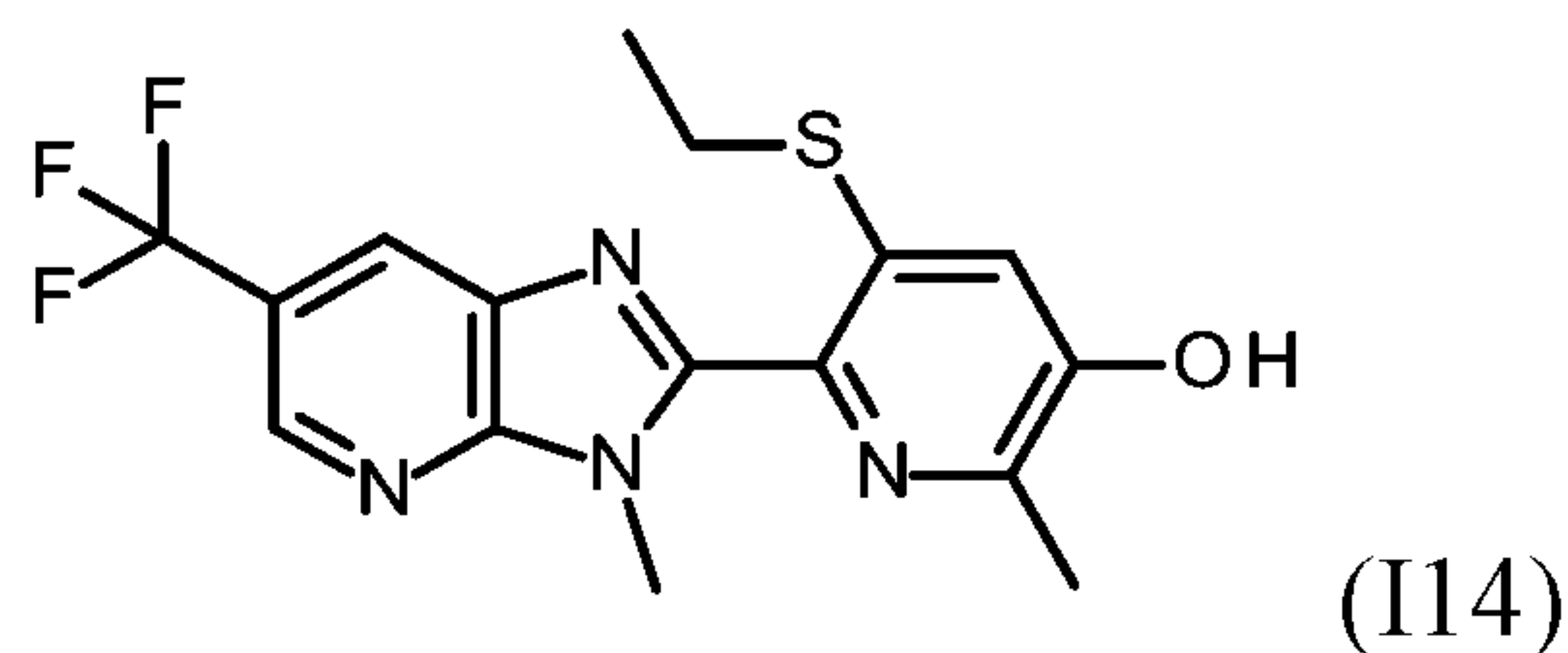
步驟1：5-乙基氫硫基-2-碘-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-3-醇（化合物I13）的製備



【0287】 在實施例P5的步驟1中所描述的相同條件下處理5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-3-醇（如實施例P3的步驟1中所描述製備的化合物I4）以給出所希望的化合物。

【0288】 LCMS（方法1）： m/z 480 $[M+H]^+$ ；保留時間：1.06 min。

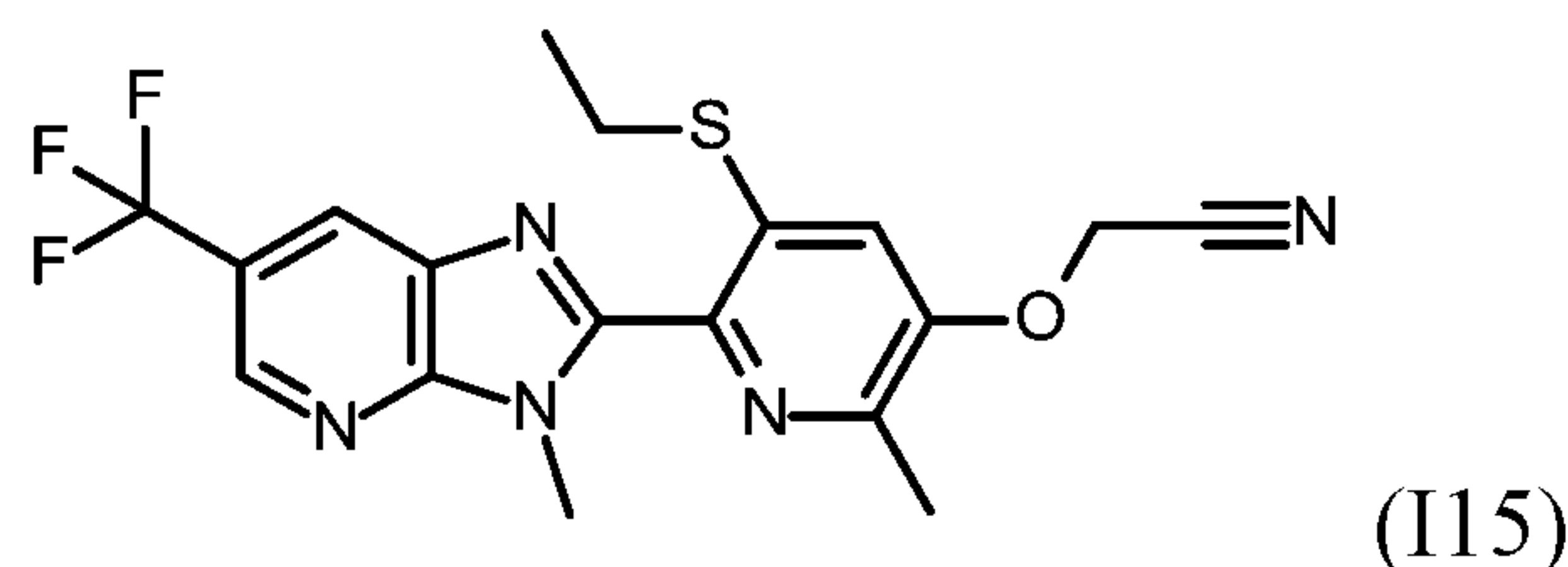
步驟2：5-乙基氫硫基-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-3-醇（化合物I14）的製備



【0289】 在實施例P5的步驟2中所描述的相同條件下處理5-乙基氫硫基-2-碘-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-3-醇（如上所描述製備的化合物I13）以給出所希望的化合物。

【0290】 LCMS（方法1）： m/z 369 $[M+H]^+$ ；保留時間：0.96 min。

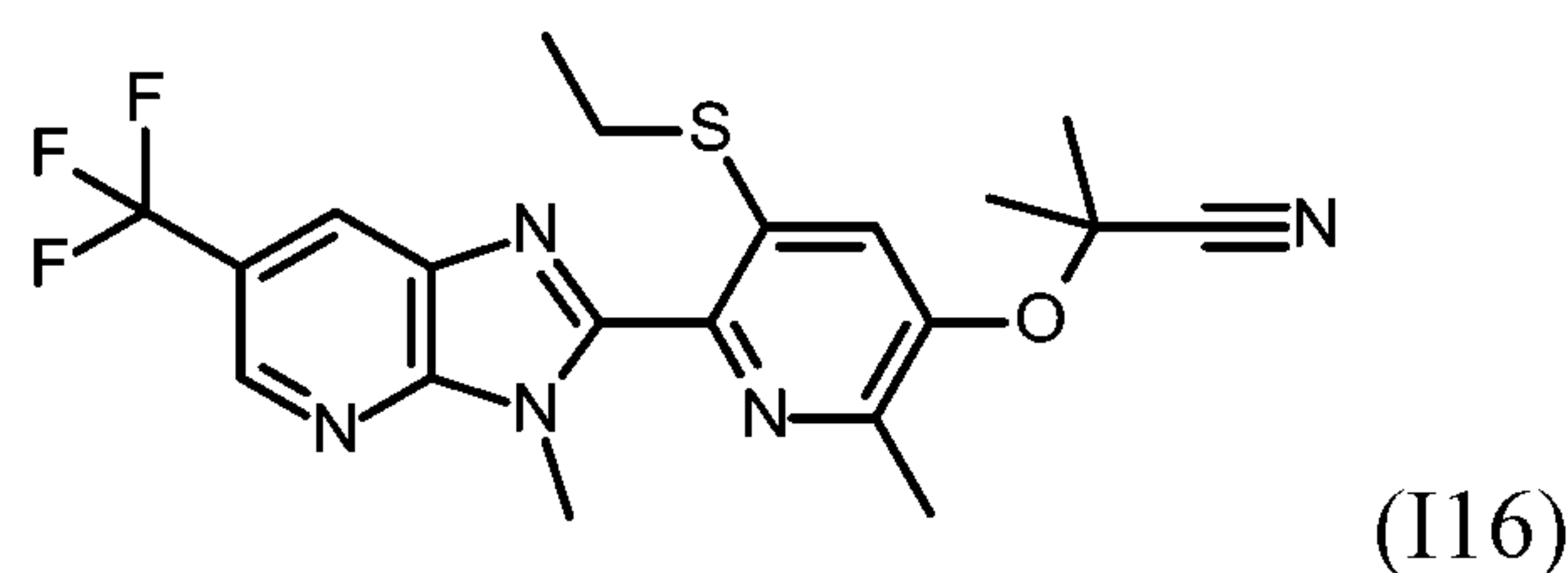
步驟3：2-[[5-乙基氫硫基-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]乙腈（化合物I15）的製備



【0291】 在實施例P5的步驟3中所描述的相同條件下處理5-乙基氫硫基-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-3-醇（如上所描述製備的化合物I14）以給出所希望的化合物。

【0292】 LCMS（方法1）： m/z 408 $[M+H]^+$ ；保留時間：1.05 min。

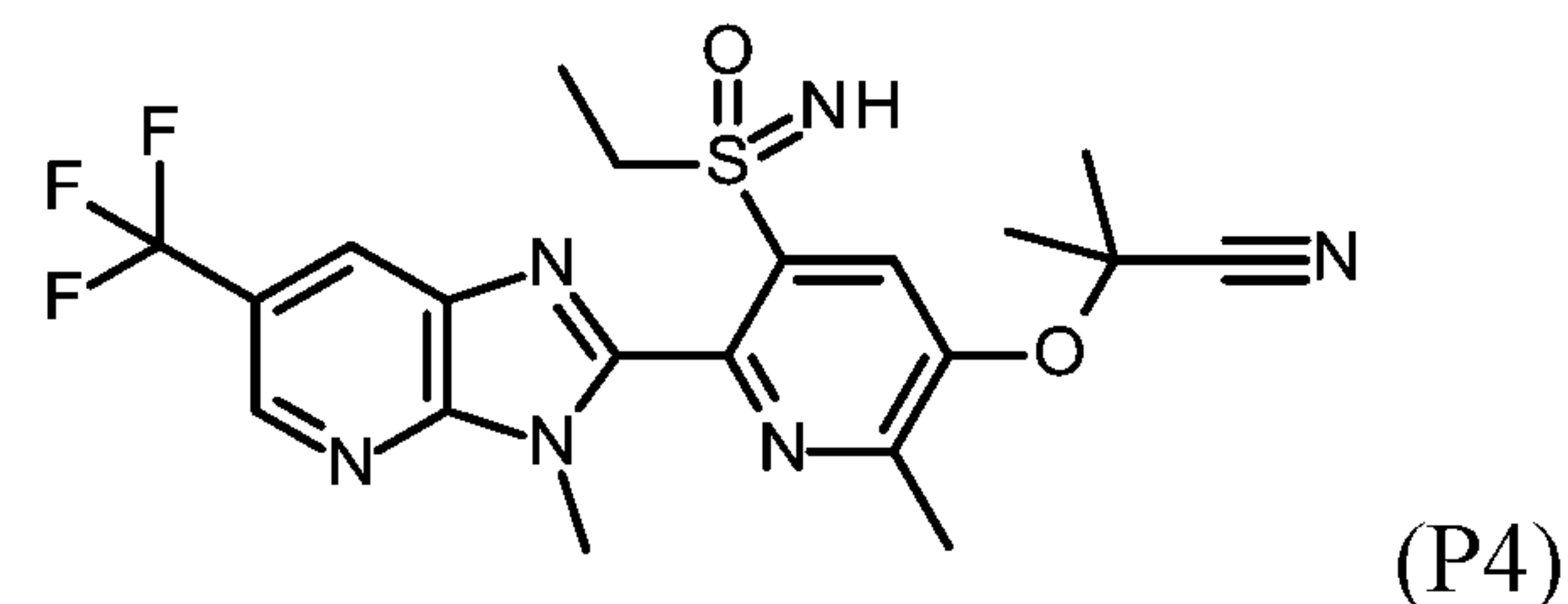
步驟4：2-[[5-乙基氫硫基-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物I16）的製備



【0293】 在實施例P5的步驟4中所描述的相同條件下處理2-[[5-乙基氫硫基-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]乙腈（如上所描述製備的化合物I15）以給出所希望的化合物。

【0294】 LCMS（方法1）： m/z 436 $[M+H]^+$ ；保留時間：1.16 min。

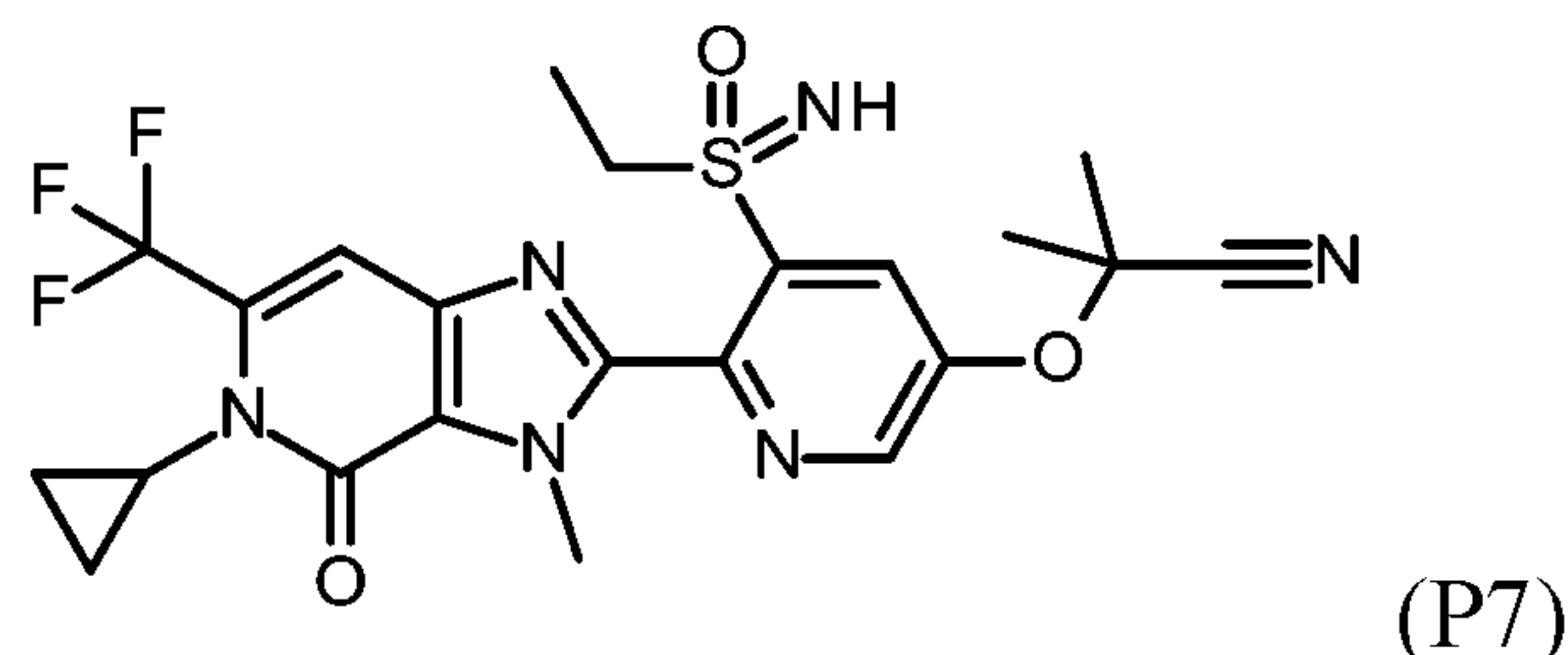
步驟5：2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P4）的製備



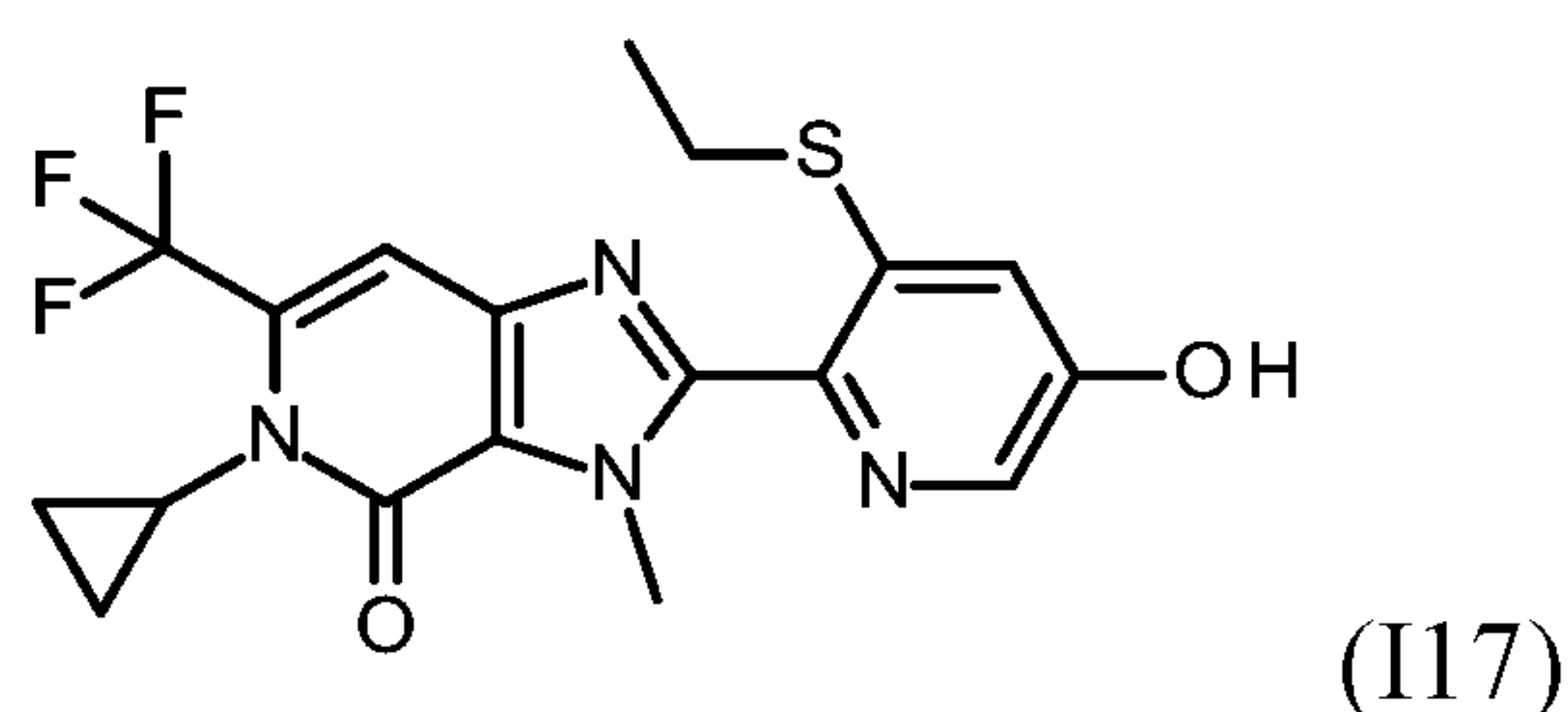
【0295】 在實施例P5的步驟5中所描述的相同條件下處理2-[[5-乙基氫硫基-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（如上所描述製備的化合物I16）以給出所希望的化合物。

【0296】 LCMS (方法1) : m/z 467 $[M+H]^+$; 保留時間 : 0.97 min。

實施例P7 : 2-[[6-[5-環丙基-3-甲基-4-側氧基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-5-(乙基磺醯亞胺基)-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈 (化合物P7) 的製備



步驟1 : 5-環丙基-2-(3-乙基氫硫基-5-羥基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-4-酮 (化合物I17) 的製備



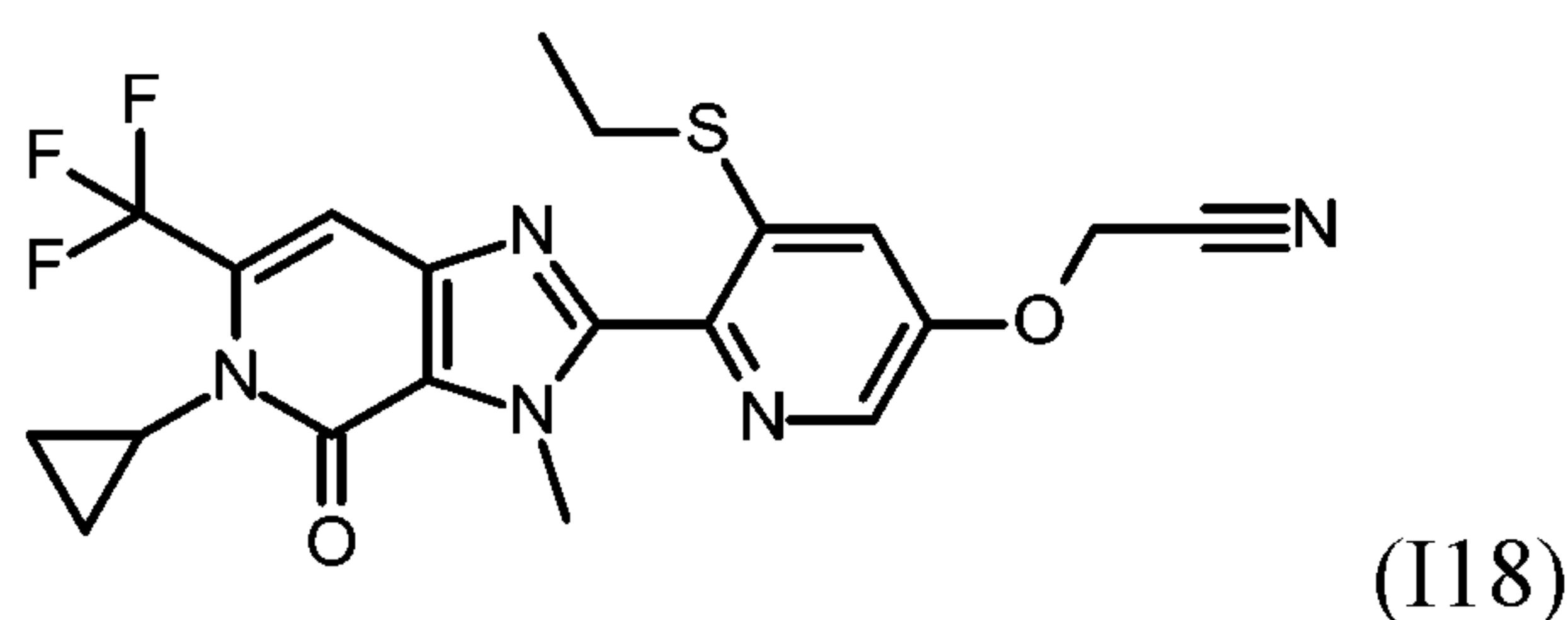
【0297】 將碳酸銨 (2.75 g, 8.43 mmol, 3.00當量) 和(E)-苯甲醛肟 (614 μ L, 5.62 mmol, 2.00當量) 添加到2-(5-溴-3-乙基氫硫基-2-吡啶基)-5-環丙基-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-4-酮 (如WO 2017089190中所描述製備) (1.33 g, 2.81 mmol) 在N,N-二甲基甲醯胺 (12 mL) 中的溶液中。將所得懸浮液在45°C下攪拌過夜。冷卻至室溫後，將反應混合物用水稀釋，並且藉由添加2N鹽酸溶液將水相的pH調節至1。將水相用乙酸乙酯萃取，將合併的有機相經硫酸鈉乾燥，過濾並且濃縮。將粗材料藉由在矽膠上快速層析法 (在環己烷中的乙酸乙酯) 純化，得到呈白色固體的所希望的產物 (1.00 g, 2.44 mmol)。

【0298】 LCMS (方法1) : m/z 355 $[M+H]^+$; 保留時間 : 0.94 min。

【0299】 ^1H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.06 (br s, 2H) 1.18-1.37 (m, 5H) 2.75 (q, $J=7.38\text{Hz}$, 2H) 3.07-3.16 (m, 1H) 4.04 (s, 3H) 7.06 (d, $J=2.45\text{Hz}$, 1H) 7.28 (m, 1H) 7.98 (d, $J=2.45\text{Hz}$, 1H)。

步驟2 : 2-[[6-[5-環丙基-3-甲基-4-側氧基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-5-

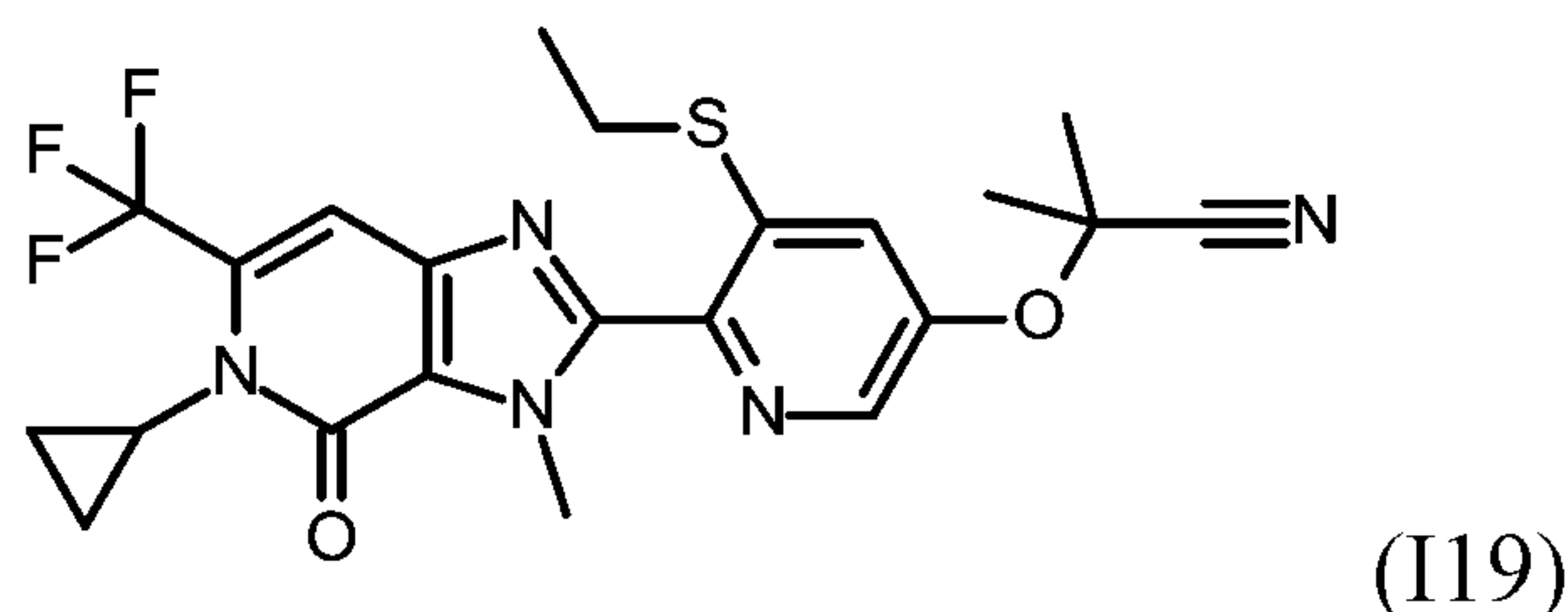
乙基氫硫基-3-吡啶基]氧基]乙腈（化合物I18）的製備



【0300】 在0°C下，在氫氣下，將碳酸鉀（404 mg，2.92 mmol，1.50當量）然後在攪拌10 min後將溴乙腈（177 μ L，2.53 mmol，1.30當量）添加到5-環丙基-2-(3-乙基氫硫基-5-羥基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-4-酮（如上所描述製備的化合物I17）（800 mg，1.95 mmol）在N,N-二甲基甲醯胺（8.0 mL）中的溶液中。在室溫攪拌2小時後，將反應混合物傾倒在冰水上，並且將水相用乙酸乙酯萃取兩次。將合併的有機相用水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並且濃縮。粗材料不經進一步純化直接使用。

【0301】 LCMS（方法3）： m/z 450 $[M+H]^+$ ；保留時間：1.481 min。

步驟3：2-[[6-[5-環丙基-3-甲基-4-側氧基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-5-乙基氫硫基-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物I19）的製備

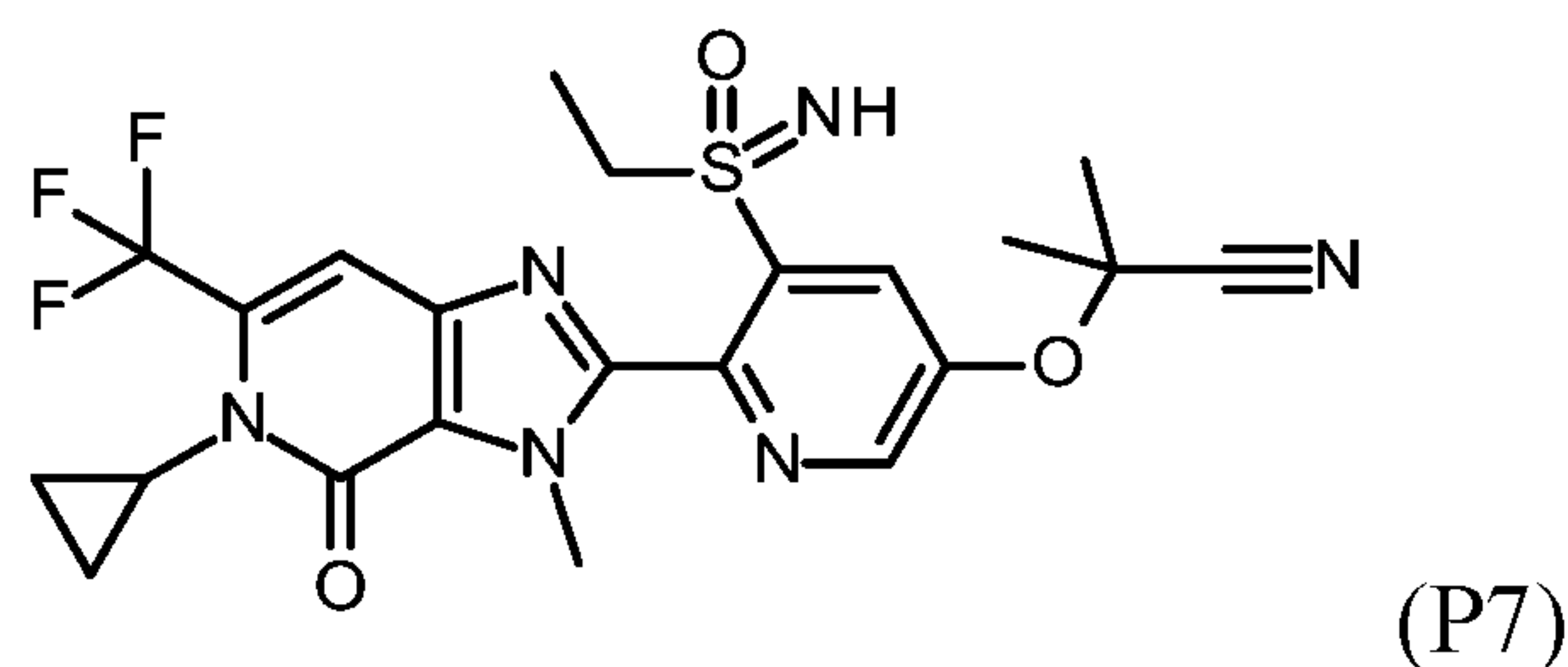


【0302】 將在四氫呋喃（2.50 mL，5.00 mmol，3.00 當量）中的2 M六甲基二矽氮烷鋰溶液逐滴添加到2-[[6-[5-環丙基-3-甲基-4-側氧基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-5-乙基氫硫基-3-吡啶基]氧基]乙腈（如上所描述製備的化合物I18）（750 mg，1.67 mmol）和碘甲烷（418 μ L，6.68 mmol，4.00當量）在於0°C冷卻的四氫呋喃（20 mL）中的溶液中。將反應混合物用冰浴攪拌2小時，並且然後藉由傾倒在飽和碳酸氫鈉水溶液上淬滅。將水相用乙酸乙酯萃取。將合併的有機相用鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並且蒸發。將粗材料藉由在矽

膠上快速層析法（在環己烷中的乙酸乙酯）純化，以得到所希望的化合物（700 mg，1.66 mmol）。

【0303】 LCMS（方法3）： m/z 478 $[M+H]^+$ ；保留時間：1.54 min。

步驟4：2-[[6-[5-環丙基-3-甲基-4-側氧基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-5-(乙基磺醯亞胺基)-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P7）的製備

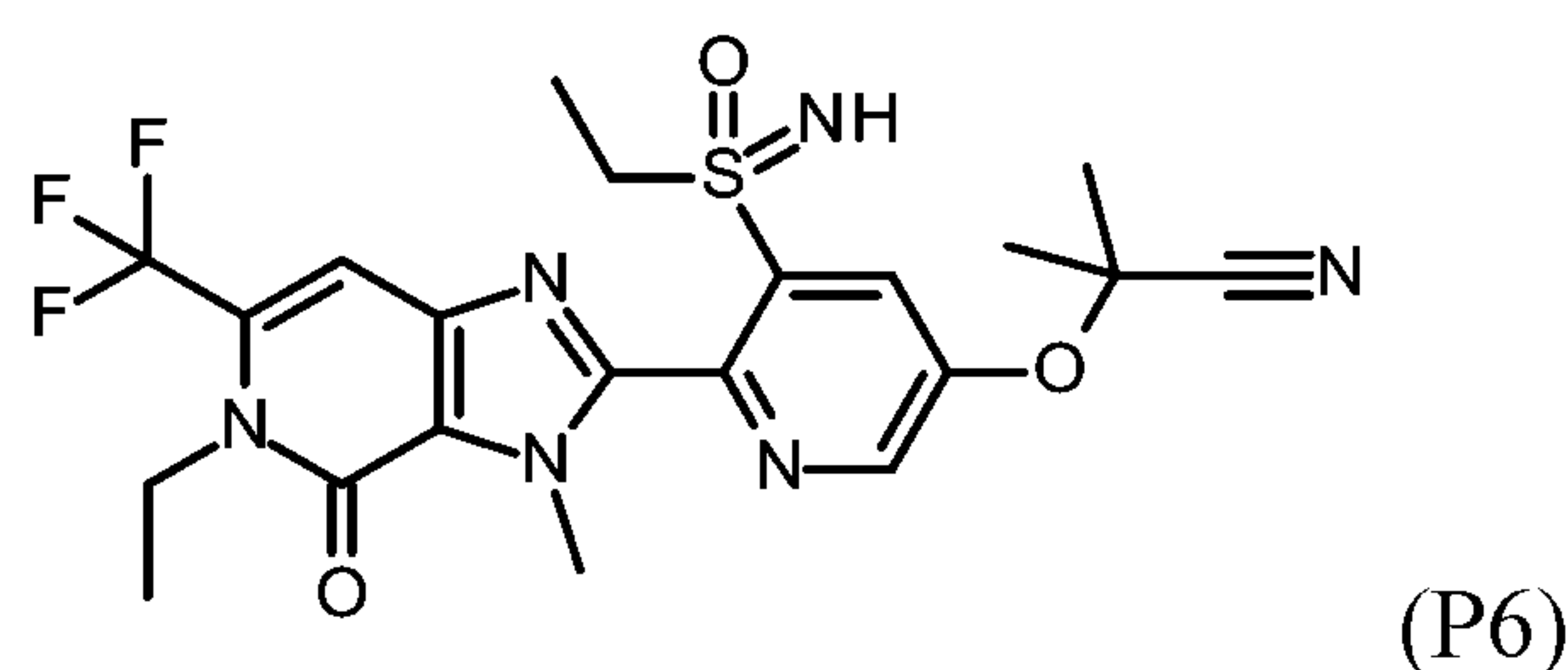


【0304】 將二乙醯氧基碘苯（275 mg，0.84 mmol，2.50當量）和胺基甲酸鉍（52 mg，0.67 mmol，2.00當量）添加到2-[[6-[5-環丙基-3-甲基-4-側氧基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-5-乙基氫硫基-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（如上所描述製備的化合物I19）（160 mg，0.34 mmol）在甲醇（5.0 mL）中的溶液中。在室溫下攪拌過夜後，將反應混合物用飽和硫代硫酸鈉水溶液淬滅。控制水相中的過氧化物的任何存在，然後用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機層經無水硫酸鈉乾燥，過濾並且在真空下濃縮。將粗產物藉由在矽膠上快速層析法（乙酸乙酯）純化，以得到呈白色固體的所希望的化合物（120 mg，0.24 mmol）。

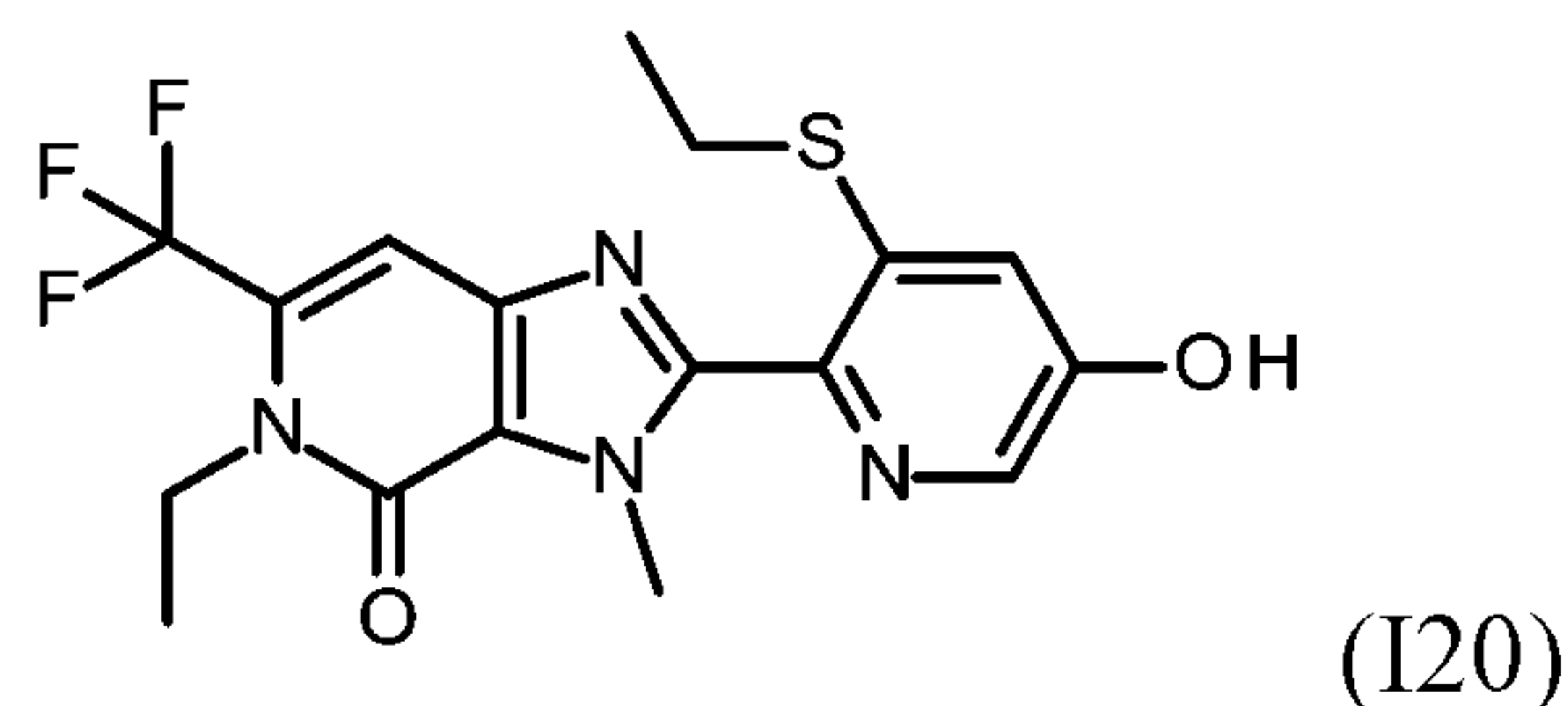
【0305】 LCMS（方法4）： m/z 509 $[M+H]^+$ ；保留時間：0.92 min。

【0306】 ^1H NMR (400 MHz, 氘仿-d) δ ppm 8.76 (d, $J=2.69\text{Hz}$, 1H) 8.35 (d, $J=2.69\text{Hz}$, 1H) 7.19 (s, 1H) 4.00-4.05 (m, 3H) 3.69-3.85 (m, 2H) 3.10 (br d, $J=3.67\text{Hz}$) 1.87-1.91 (m, 6H) 1.21-1.42 (m, 8H) 1.07 (br s, 2H)。

實施例P6：2-[[6-[5-乙基-3-甲基-4-側氧基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-5-(乙基磺醯亞胺基)-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P6）的製備



步驟1：5-乙基-2-(3-乙基氫硫基-5-羥基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-4-酮（化合物I20）的製備



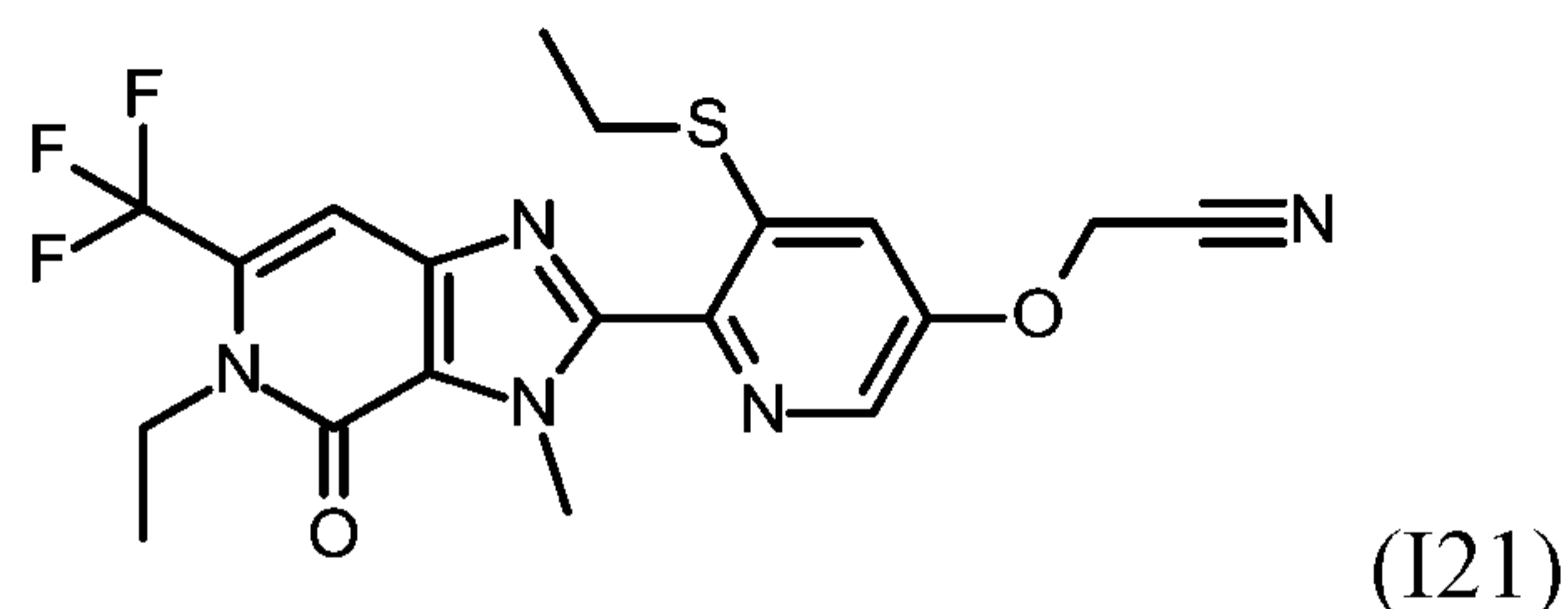
【0307】 在實施例P7的步驟1中所描述的相同條件下處理2-(5-溴-3-乙基氫硫基-2-吡啶基)-5-乙基-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-4-酮（如WO 2017084879中所描述製備）以給出所希望的化合物。

【0308】 LCMS（方法3）： m/z 399 $[M+H]^+$ ；保留時間：1.38 min。

1H NMR (400 MHz, 氫仿-d) δ ppm 7.99 (m, 1H) 7.29 (m, 1H) 7.06 (m, 1H) 4.26 (q, $J=6.89$ Hz,

【0309】 2H) 4.08 (s, 3H) 2.75 (q, $J=7.46$ Hz, 2H) 1.42-1.37 (m, 3H) 1.18-1.23 (m, 3 H)。

步驟2：2-[[6-[5-乙基-3-甲基-4-側氧基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-5-乙基氫硫基-3-吡啶基]氧基]乙腈（化合物I21）的製備



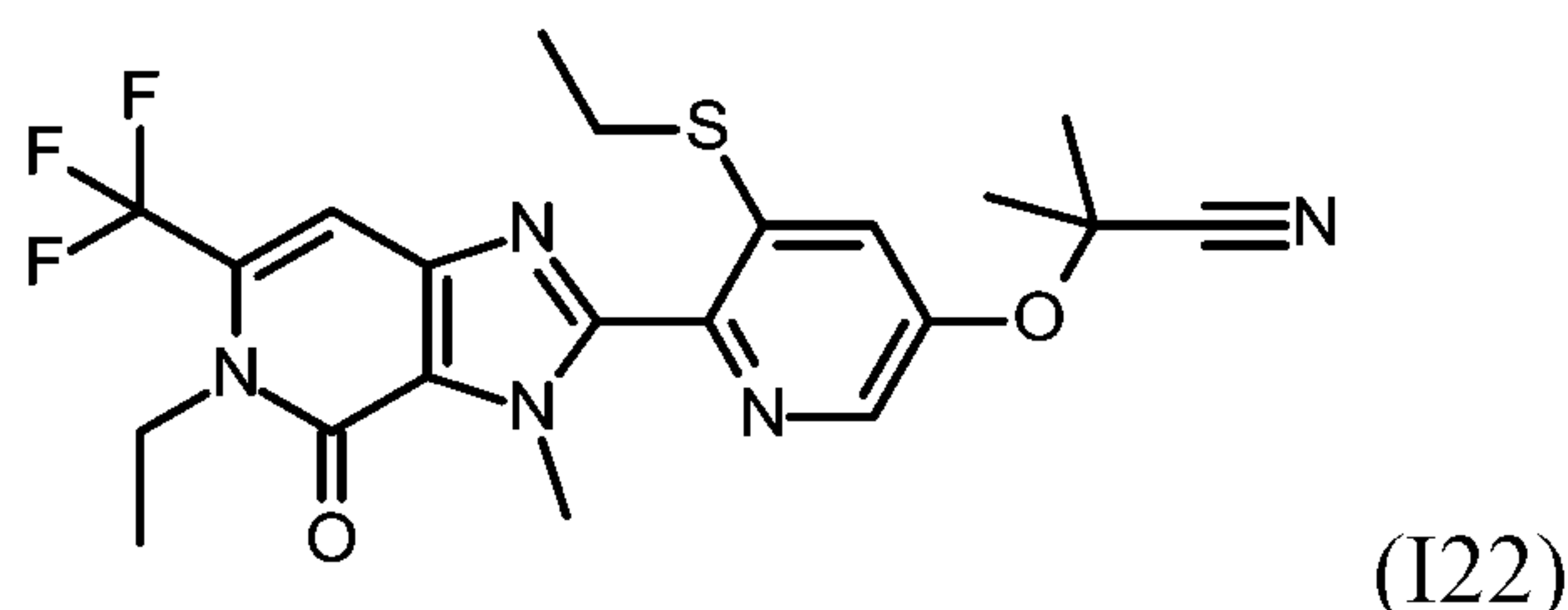
【0310】 在實施例P7的步驟2中所描述的相同條件下處理5-乙基-2-(3-乙基氫硫基-5-羥基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-4-酮（如上所描述製備的化合物I20）以給出所希望的化合物。

【0311】 LCMS (方法4) : m/z 438 $[M+H]^+$; 保留時間 : 1.01 min。

1H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 8.25 (m, 1H) 7.33 (m, 1H) 7.31 (m, 1H) 4.93 (m,

【0312】 2H) 4.28 (m, 2H) 4.20 (m, 3H) 2.95 (m, 2H) 1.41-1.34 (m, 6H)。

步驟3 : 2-[[6-[5-乙基-3-甲基-4-側氧基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-5-乙基氫硫基-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈 (化合物I22) 的製備

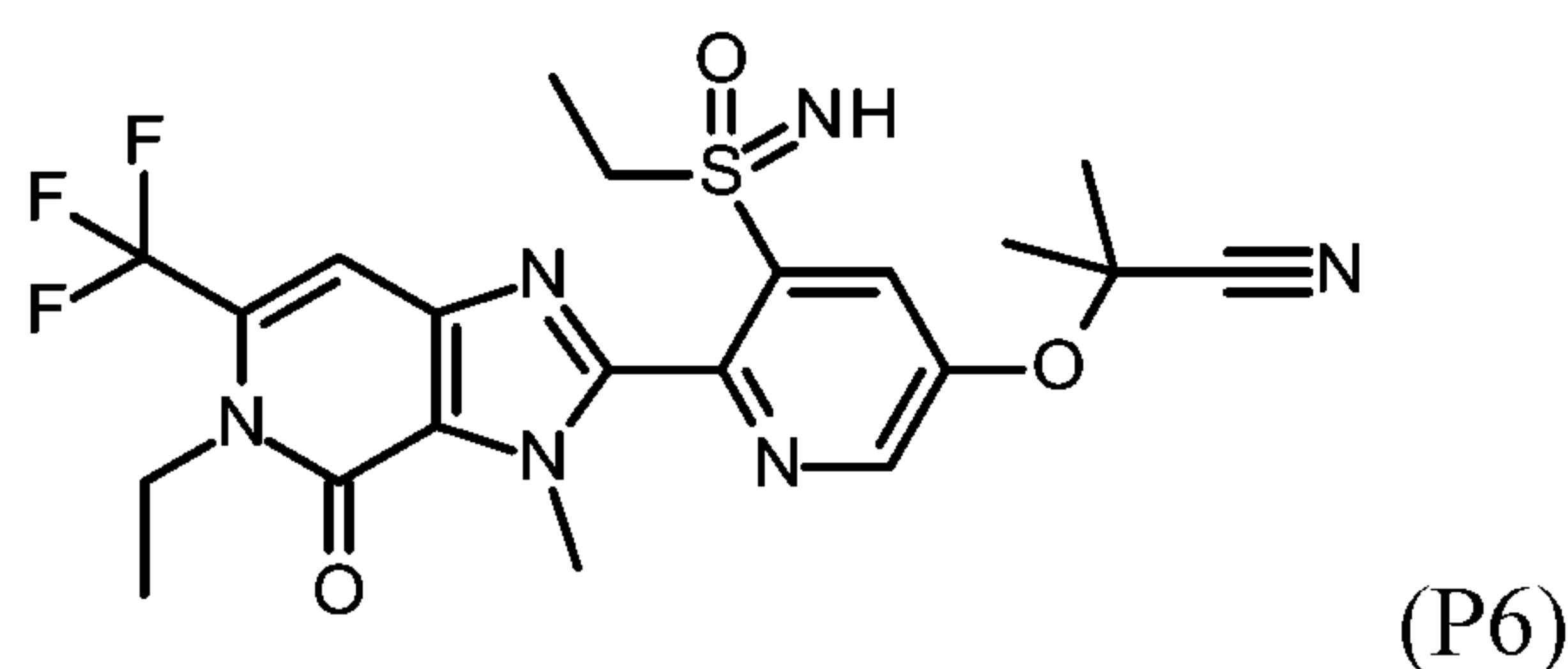


【0313】 在如實施例P7的步驟3中所描述的相同條件下處理2-[[6-[5-乙基-3-甲基-4-側氧基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-5-乙基氫硫基-3-吡啶基]氧基]乙腈 (如上所描述製備的化合物I21) 以給出所希望的化合物。

【0314】 LCMS (方法4) : m/z 466 $[M+H]^+$; 保留時間 : 1.10 min。

【0315】 1H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 8.31 (m, 1H) 7.65 (m, 1H) 7.32 (m, 1H) 4.25 (m, 6H) 2.96 (m, 2H) 1.81-1.84 (m, 6H)。

步驟4 : 2-[[6-[5-乙基-3-甲基-4-側氧基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-5-(乙基磺醯亞胺基)-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈 (化合物P6) 的製備



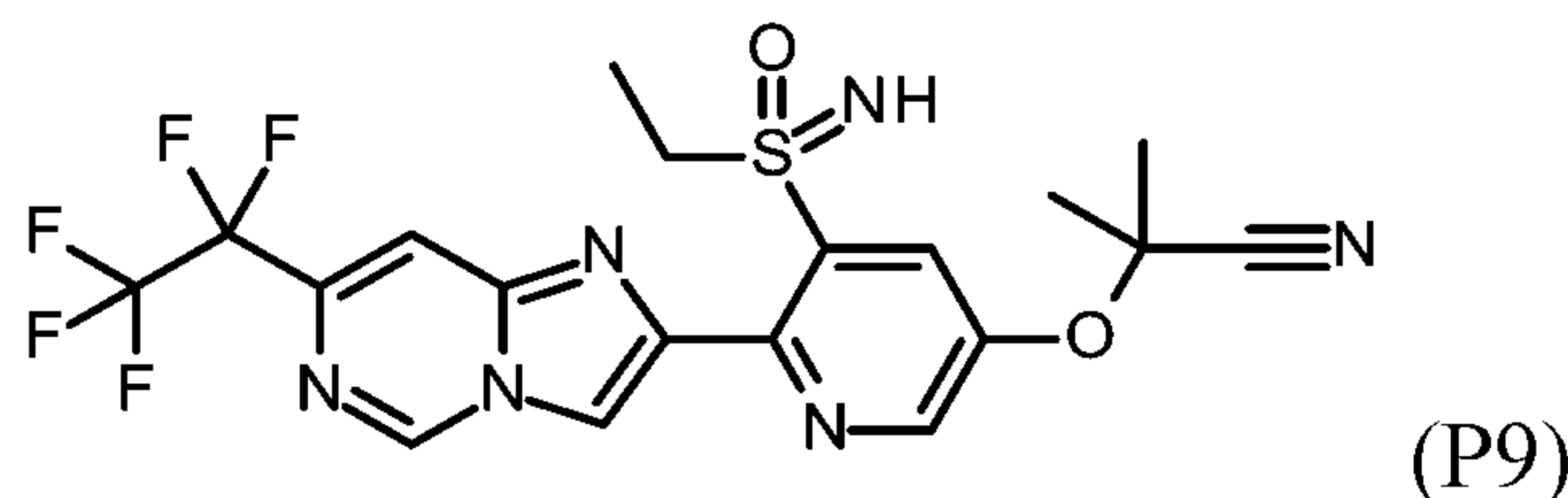
【0316】 在如實施例P7的步驟4中所描述的相同條件下處理2-[[6-[5-乙基-3-甲基-4-側氧基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-5-乙基氫硫基-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈 (如上所描述製備的化合物I22) 以給出所希望的化合物。

【0317】 LCMS (方法4) : m/z 497 $[M+H]^+$; 保留時間 : 0.93 min。

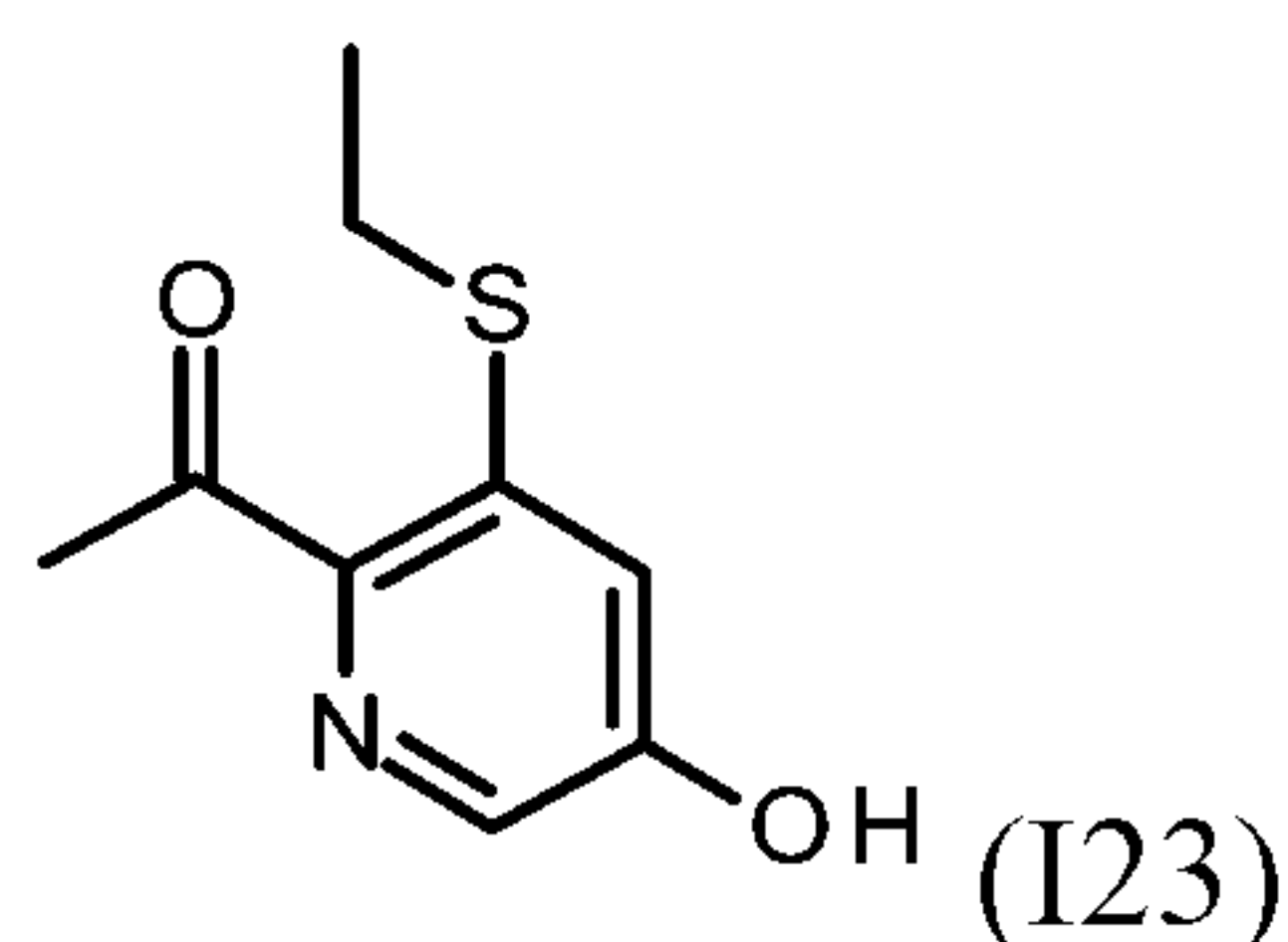
【0318】 1H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 8.77 (m, 1H) 8.35 (m, 1H) 7.21

(m, 1H) 4.25 (m, 3H) 4.07 (m, 3H) 3.76 (m, 2H) 1.87-1.92 (m, 6H)。

實施例P9：2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-(1,1,2,2,2-五氟乙基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P9）的製備



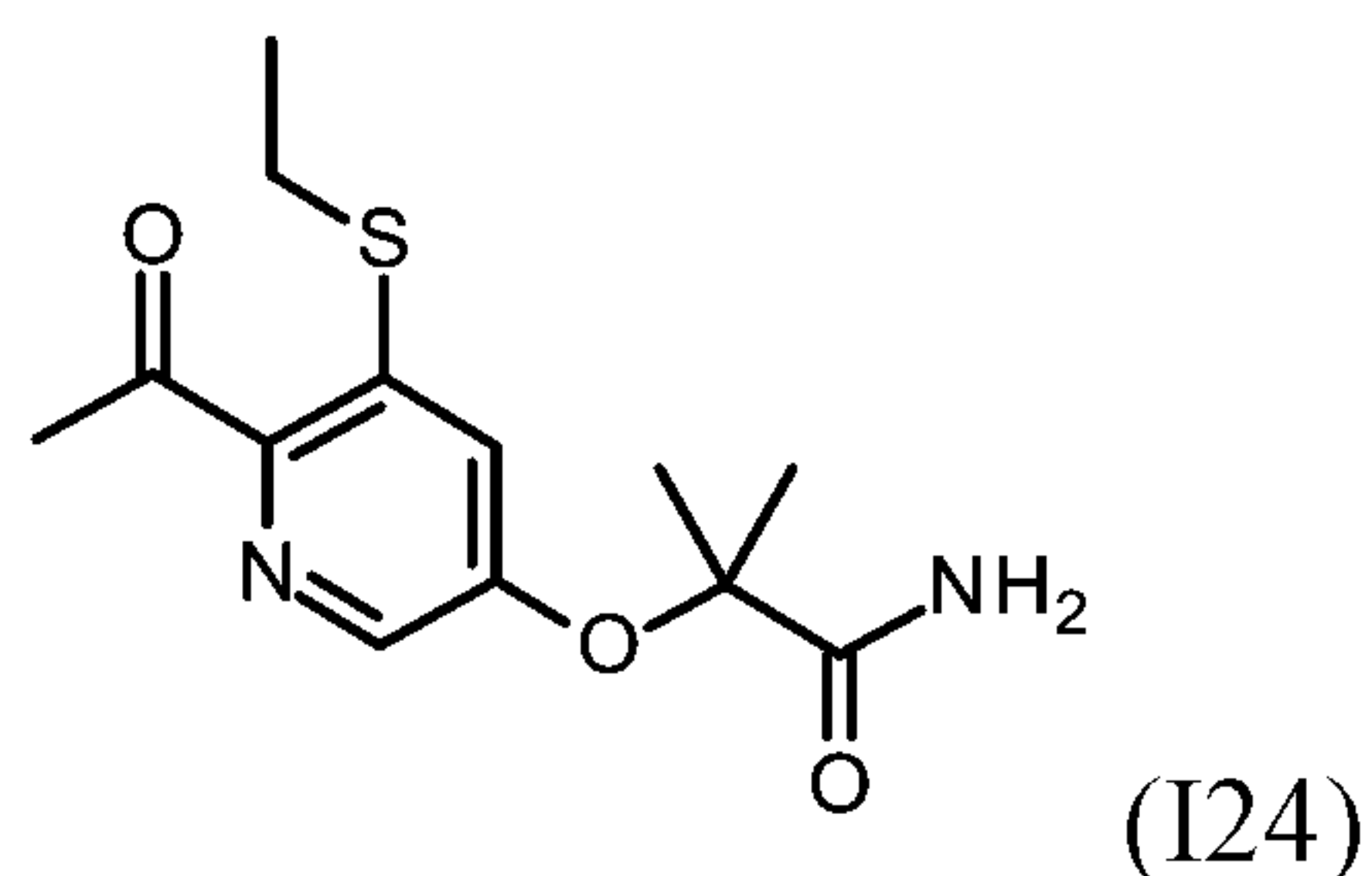
步驟1：1-(3-乙基氫硫基-5-羥基-2-吡啶基)乙酮（化合物I23）的製備



【0319】 將碳酸銨（6.65 g，20.40 mmol，2.20當量）和(E)-苯甲醛肟（1.32 mL，12.1 mmol，1.30當量）添加到1-(5-氯-3-乙基氫硫基-2-吡啶基)乙酮（如WO 2016071214中所描述製備）（2.00 g，9.27 mmol）在N,N-二甲基甲醯胺（18 mL）中的溶液中。將所得懸浮液在室溫下攪拌過夜。將反應混合物用水稀釋，並且藉由添加1N鹽酸溶液將水相的pH調節至1。將水相用乙酸乙酯萃取，將合併的有機相經硫酸鈉乾燥，過濾並且濃縮。將粗材料藉由在矽膠上快速層析法（在環己烷中的乙酸乙酯）純化，得到呈白色固體的所希望的產物（1.47 g，2.44 mmol）。

【0320】 ^1H NMR (400 MHz, 二甲基亞砜- d_6) δ ppm 1.28 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 2.86 (q, $J=7.34\text{Hz}$, 2H) 3.33 (s, 3H) 7.15 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H) 7.98 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H) 10.94 (s br, 1H)。

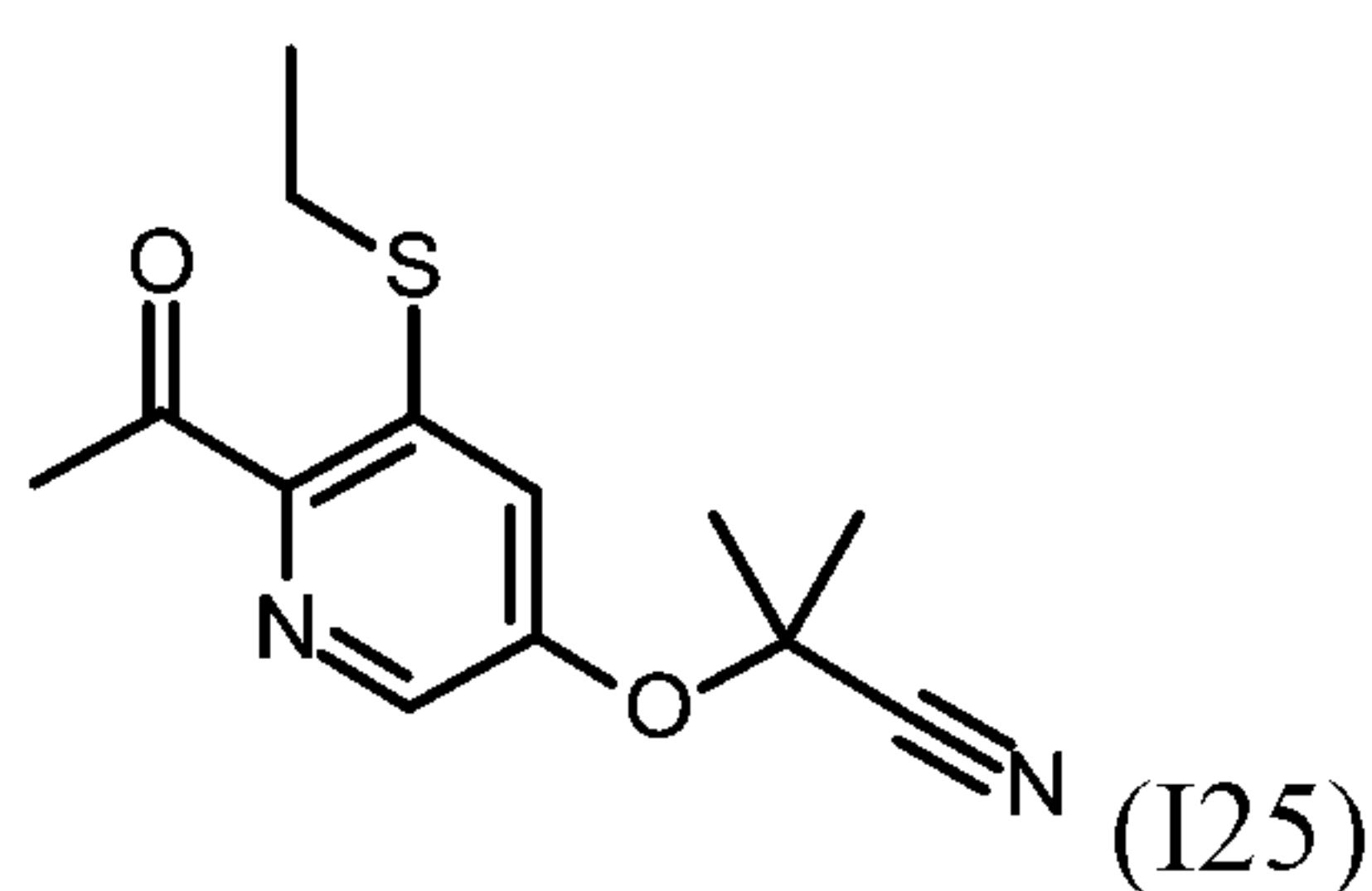
步驟2：2-[(6-乙醯基-5-乙基氫硫基-3-吡啶基)氧基]-2-甲基-丙醯胺（化合物I24）的製備



【0321】 將碳酸銨（9.2 g，28 mmol，1.5當量）添加到1-(3-乙基氫硫基-5-羥基-2-吡啶基)乙酮（如上所描述製備的化合物I23）（3.7 g，19 mmol）在乙腈（94 mL）中的溶液中。將所得懸浮液攪拌5 min，然後添加2-溴-2-甲基-丙醯胺（5.0 g，30 mmol，1.6當量），並且將反應混合物加熱並且在室溫下攪拌過夜。冷卻至室溫後，將反應混合物傾倒在水上，並且將水相用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機相經硫酸鈉乾燥，過濾並且濃縮。粗材料無需進一步純化即可用於下一步驟。

【0322】 ^1H NMR (400 MHz, 二甲基亞砜- d_6) δ ppm 1.28 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.56 (s, 6H) 1.85 (s, 3H) 2.83 (q, $J=7.34\text{Hz}$, 2H) 7.15 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H) 7.33 (s, 1H) 7.45 (s, 1H) 8.04 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H)。

步驟3：2-[(6-乙醯基-5-乙基氫硫基-3-吡啶基)氧基]-2-甲基-丙腈（化合物I25）的製備

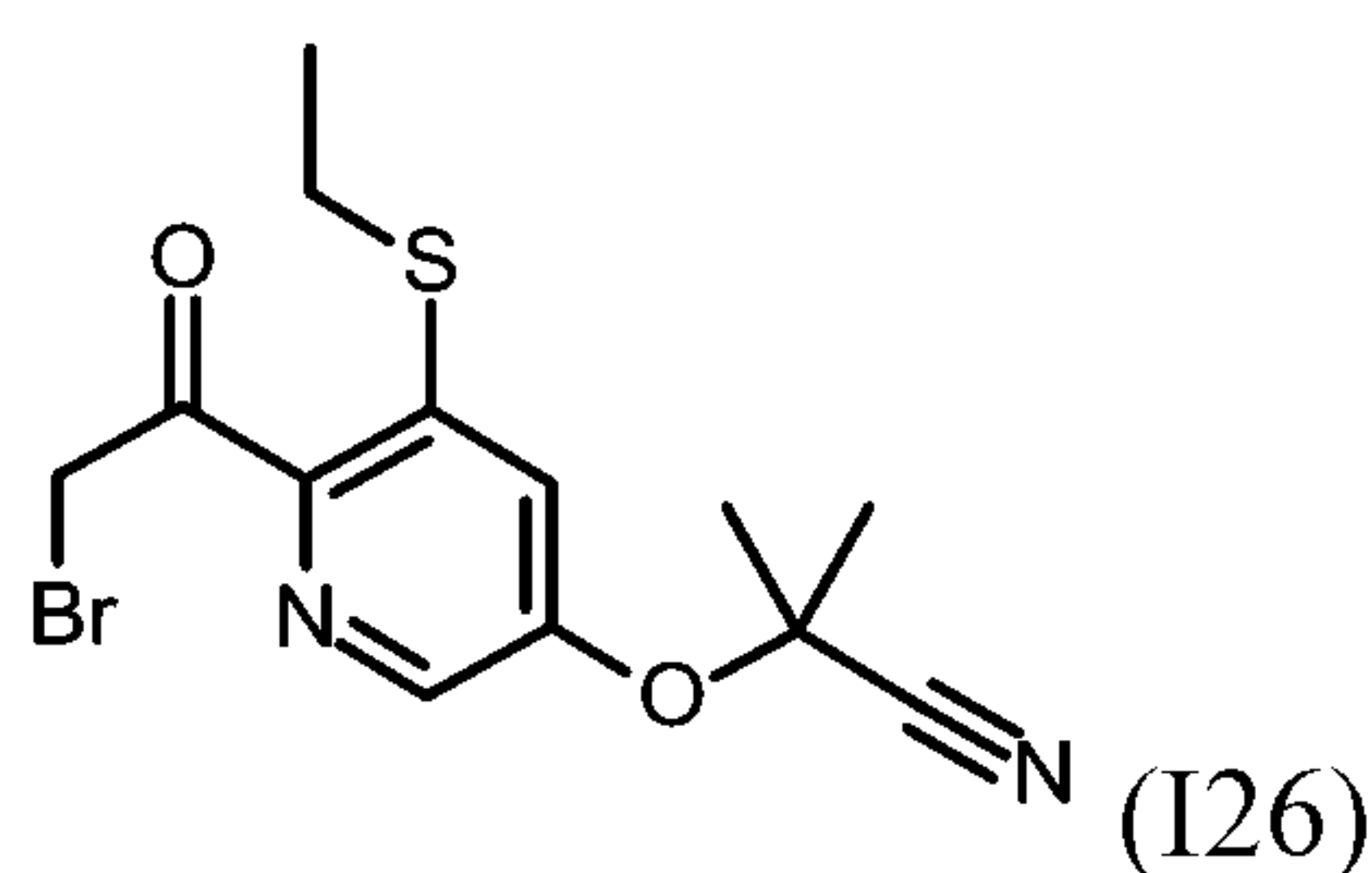


【0323】 在 0°C 下，將三氟乙酸酐（6.27 mL，44.6 mmol，3.00當量）添加到2-[(6-乙醯基-5-乙基氫硫基-3-吡啶基)氧基]-2-甲基-丙醯胺（如上所描述製備的化合物I24）（6.0 g，14.9 mmol）在二氯甲烷（149 mL）和三乙胺（8.38 mL，59.5 mmol，4.00當量）中的溶液中。在室溫下攪拌2小時後，藉由添加甲醇，然後添加飽和碳酸氫鈉溶液小心地淬滅反應混合物。將水相用二氯甲烷萃取兩次，將

合併的有機層經硫酸鈉乾燥，過濾並且濃縮。粗材料藉由在矽膠上快速層析法（在環己烷中的0-100%乙酸乙酯）純化，以給出呈黃色油狀物的所希望的產物（3.69 g）。

【0324】 ^1H NMR (400 MHz, 氯仿- d) δ ppm 1.44 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.83 (s, 6H) 2.71 (s, 3H) 2.93 (q, $J=7.34\text{Hz}$, 2H) 7.57 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H) 8.22 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H)。

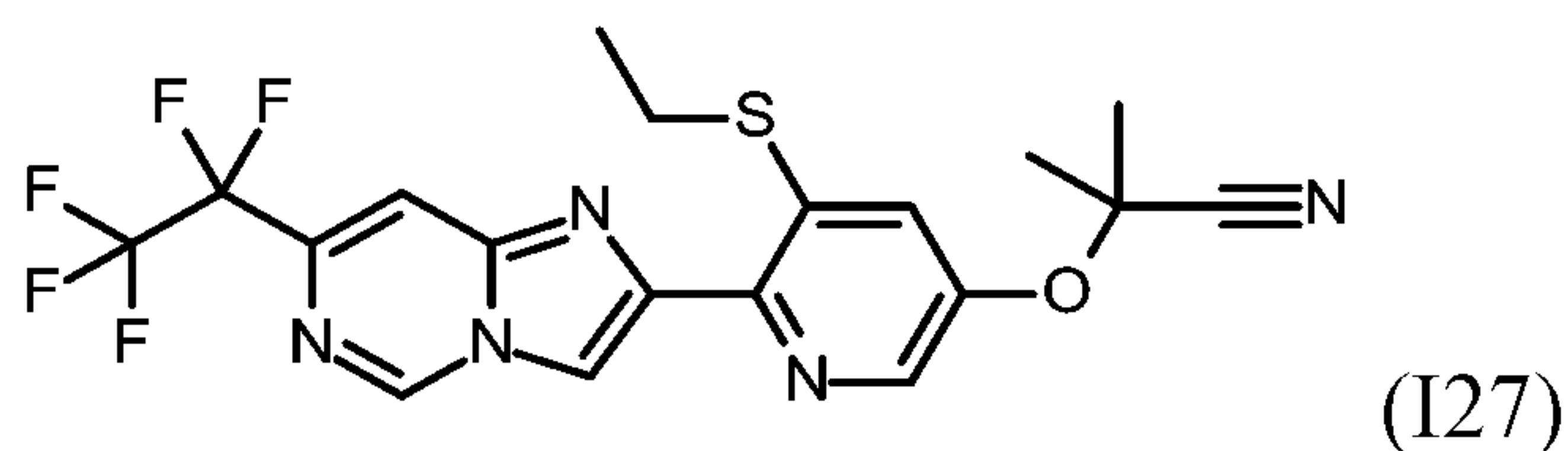
步驟4：2-[[6-(2-溴乙醯基)-5-乙基氫硫基-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物I26）的製備



【0325】 將三甲基(苯基)三溴化銨（1.43 g，3.78 mmol）添加到2-[[6-乙醯基-5-乙基氫硫基-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（如上所描述製備的化合物I25）（1.00 g，3.78 mmol）在四氫呋喃（14.4 mL，新開瓶）中的0°C冷卻溶液中。將所得橙色懸浮液在室溫下攪拌42小時，然後用水淬滅反應。將水相用乙酸乙酯萃取三次，將合併的有機相用鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並且濃縮。將粗黃色油狀物在含有一些二氯甲烷（1.0 mL）的冷環己烷（15 mL）中研磨以獲得沈澱，將其過濾並且用環己烷洗滌，得到呈黃色固體的所希望的化合物（812 mg）。將濾液藉由在矽膠上快速層析法（在環己烷中的乙酸乙酯）純化，以給出第二部分純度較低的呈黃色油狀物的所希望的化合物（500 mg）。

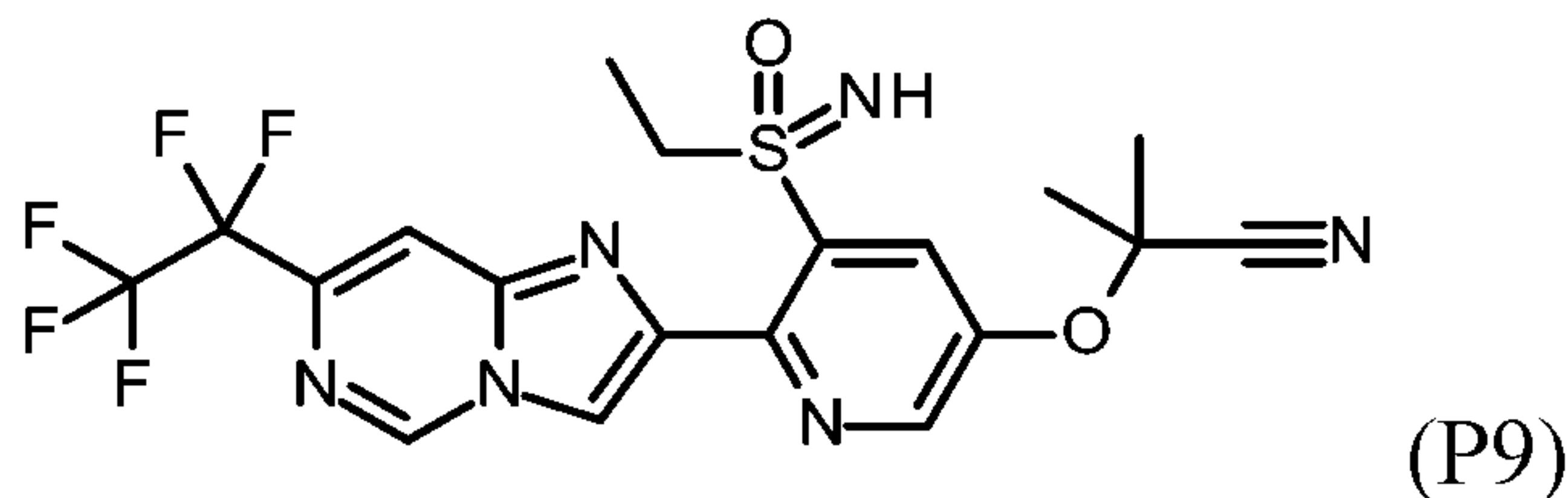
【0326】 ^1H NMR (400 MHz, 氯仿- d) δ ppm 1.45 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.85 (s, 6H) 2.96 (q, $J=7.34\text{Hz}$, 2H) 4.82 (s, 2H) 7.59 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 8.21 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H)。

步驟5：2-[[5-乙基氫硫基-6-[7-(1,1,2,2,2-五氟乙基)咪唑并[1,2- c]嘧啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物I27）的製備



【0327】 將2-[[6-(2-溴乙醯基)-5-乙基氫硫基-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（如上所描述製備的化合物I26）（250 mg，0.73 mmol）和6-(1,1,2,2,2-五氟乙基)嘧啶-4-胺（根據WO 2016071214製備）（163 mg，0.76 mmol）在乙腈（5.5 mL）中的懸浮液在70°C下加熱並且攪拌過夜。冷卻至室溫後，將混合物傾倒在水上，並且將水相用乙酸乙酯萃取。將合併的有機相用鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並且濃縮。粗材料部分地藉由在矽膠上快速層析法（在環己烷中的乙酸乙酯）純化，以給出所希望的產物的混合物，其含有一些6-(1,1,2,2,2-五氟乙基)嘧啶-4-胺，其無需進一步純化即可用於下一步驟。

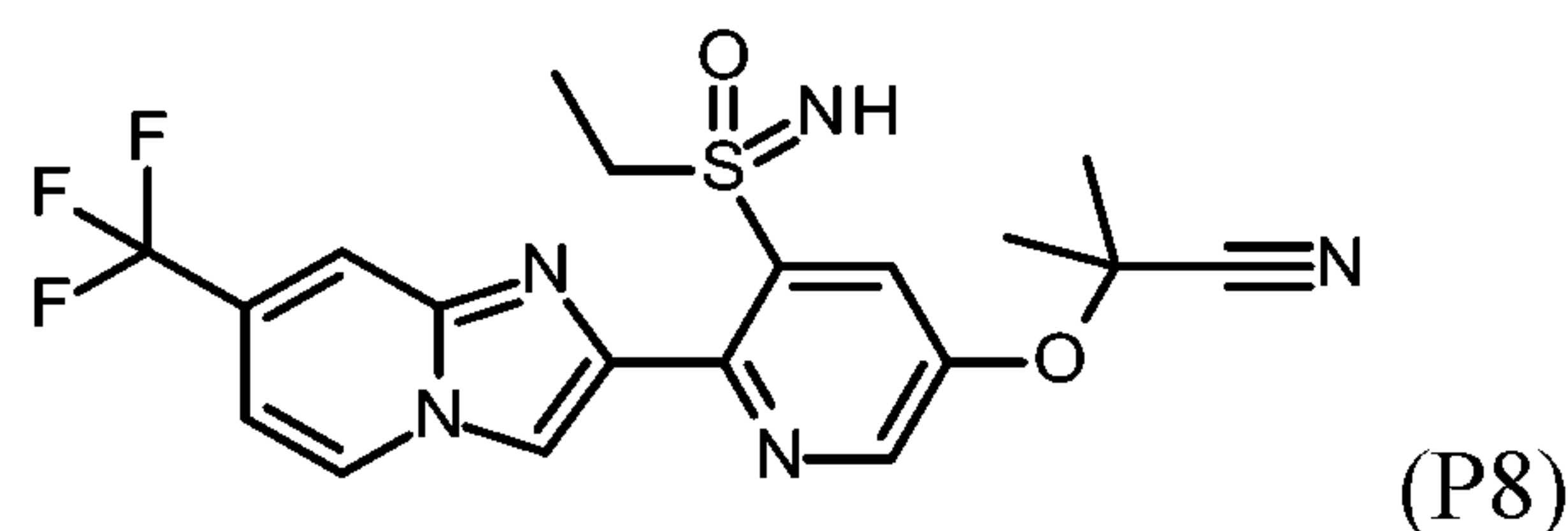
步驟6：2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-(1,1,2,2,2-五氟乙基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P9）的製備



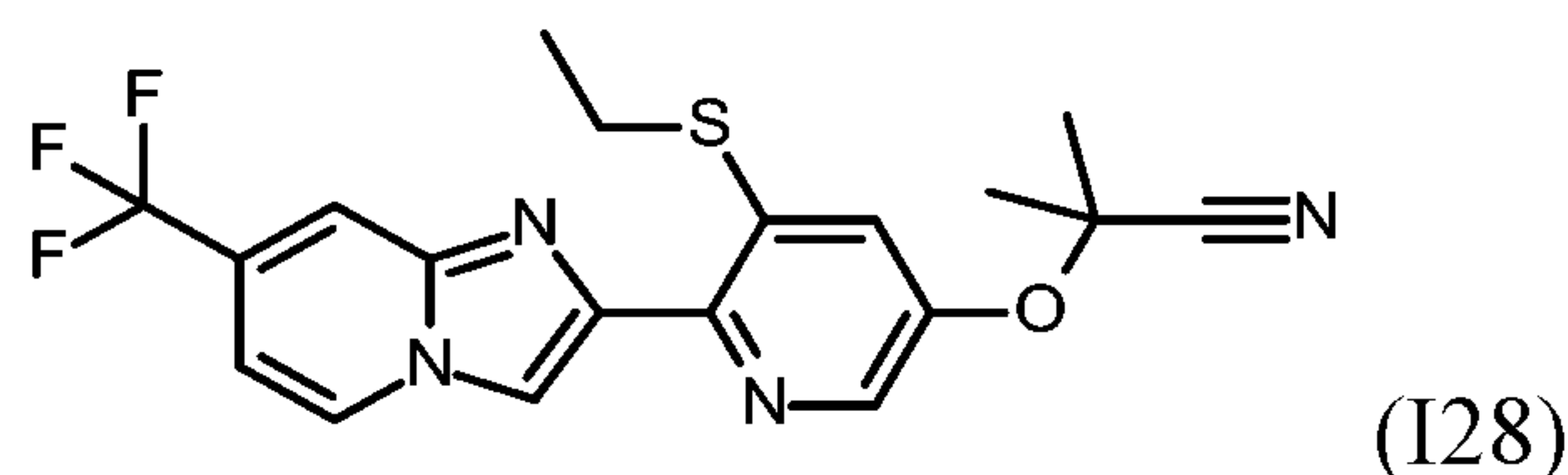
【0328】 將二乙醯氧基碘苯（194 mg，0.59 mmol，2.95當量）和胺基甲酸銨（39 mg，0.49 mmol，2.45當量）添加到2-[[5-乙基氫硫基-6-[7-(1,1,2,2,2-五氟乙基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（如上所描述製備的化合物I27）（90 mg，0.20 mmol）在甲醇（0.59 mL）中的溶液中。在室溫下攪拌30 min後，將反應混合物用飽和硫代硫酸鈉水溶液淬滅。控制水相中的過氧化物的任何存在，然後用乙酸乙酯萃取兩次。將合併的有機層用鹽水洗滌，經無水硫酸鈉乾燥，過濾並且在真空下濃縮。粗產物藉由在矽膠上快速層析法（在二氯甲烷中的甲醇）純化，然後進行兩次反相分離，以得到呈白色固體的所希望的化合物（36 mg）。

【0329】 ^1H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.40 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.87 (s, 3H) 1.89 (s, 3H) 3.81-4.00 (m, 2H) 8.03 (s, 1H) 8.40 (s, 1H) 8.42 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 8.75 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 9.20 (s, 1H)。

實施例P8：2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P8）的製備



步驟1：2-[[5-乙基氫硫基-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物I28）的製備

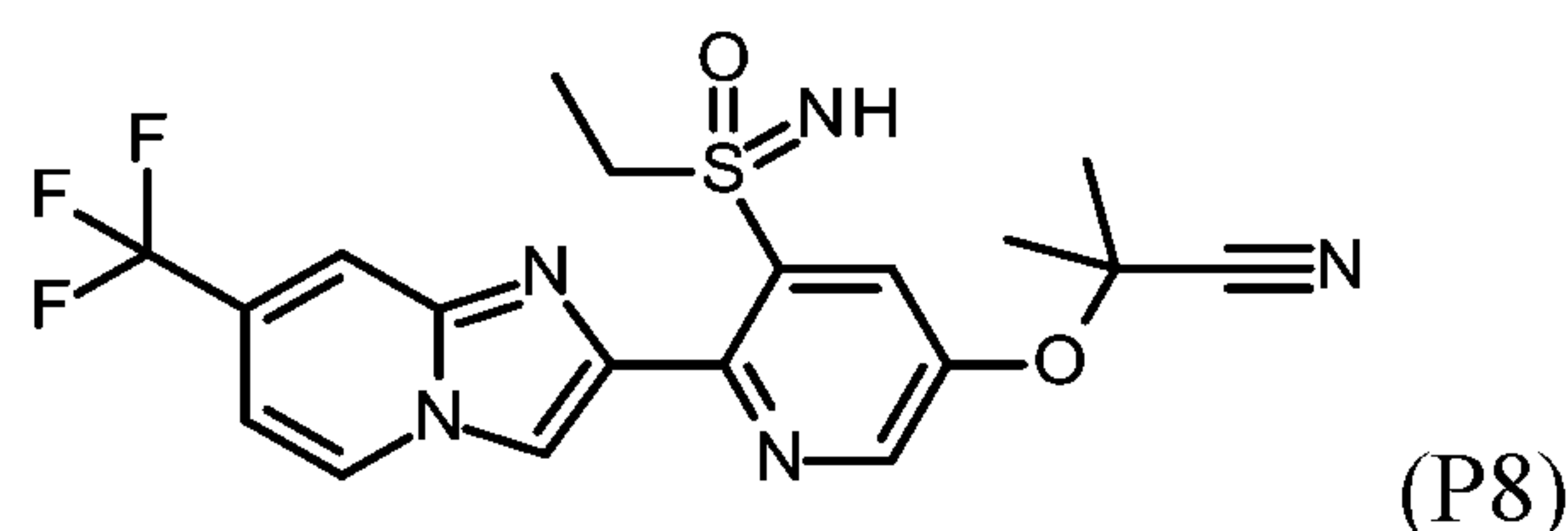


【0330】 將2-[[6-(2-溴乙醯基)-5-乙基氫硫基-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（如上實施例P9的步驟4中所描述製備的化合物I26）（100 mg, 0.20 mmol）和4-(三氟甲基)吡啶-2-胺（可商購獲得）（35 mg, 0.21 mmol）在乙腈（1.5 mL）中的懸浮液在70°C下加熱並且攪拌過夜。將氧化鎂（8 mg, 0.20 mmol）添加到反應混合物中，並且繼續加熱3小時以達到反應完成。冷卻至室溫後，將混合物傾倒在水上，並且將水相用乙酸乙酯萃取兩次。將合併的有機相用鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並且濃縮。將粗材料部分地藉由在矽膠上快速層析法（在環己烷中的乙酸乙酯）純化，以得到呈黃色油狀物的所希望的產物（60 mg）。

【0331】 ^1H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.44 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.81 (s, 6H) 3.04 (q, $J=7.34\text{Hz}$, 2H) 7.02 (dd, $J_1=7.34$; $J_2=1.65\text{Hz}$, 1H) 7.65 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 8.06 (s, 1H) 8.29 (d, $J=7.34\text{Hz}$, 1H) 8.32 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 8.37 (d, $J=1.65\text{Hz}$, 1H)。

步驟2：2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基]-3-吡啶

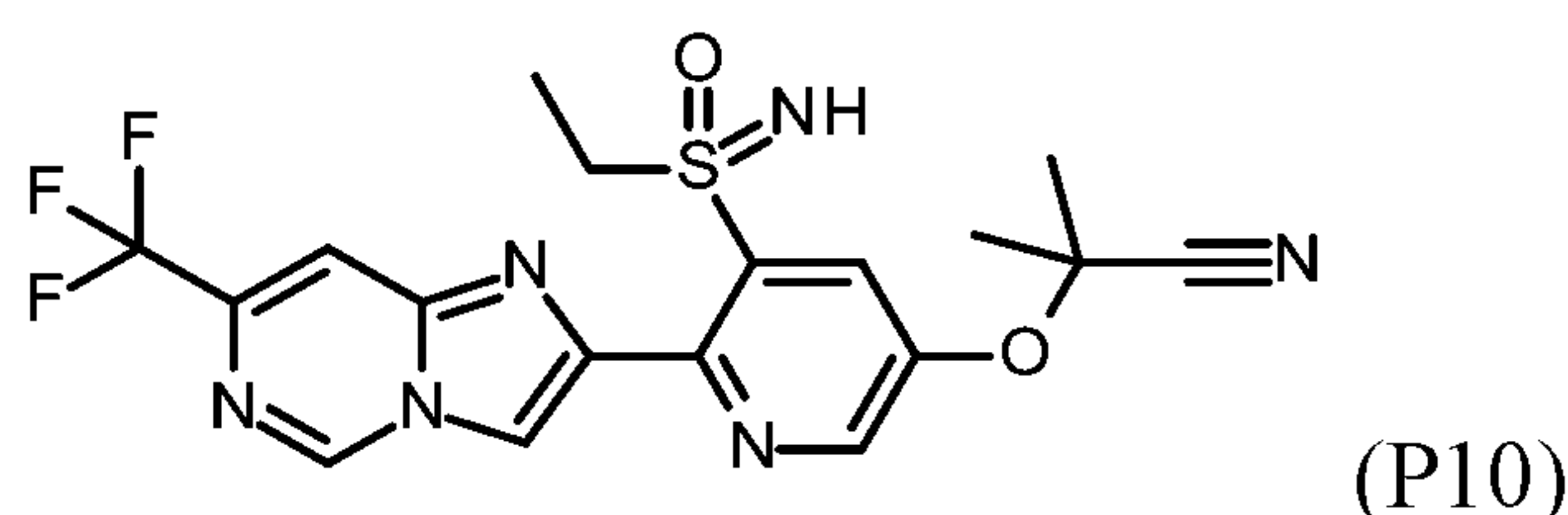
基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P8）的製備



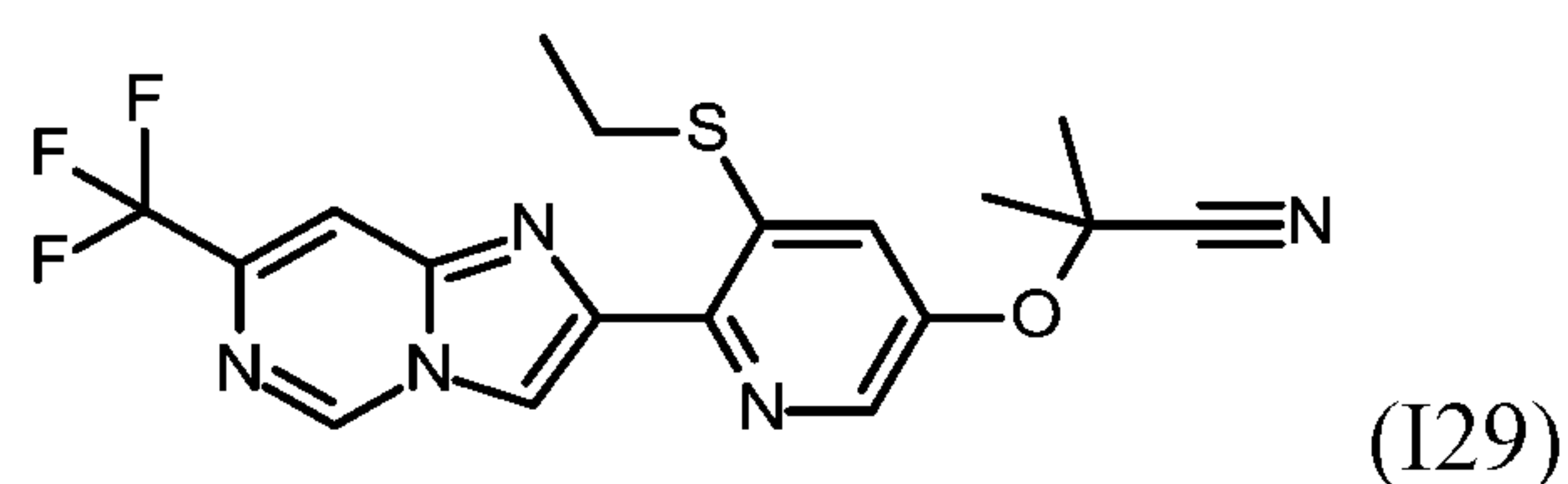
【0332】 在如實施例P9的步驟6中所描述的相同條件下處理2-[[5-乙基氫硫基-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（如上所描述製備的化合物I28）以給出所希望的化合物。

【0333】 ^1H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.37 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.85 (s, 3H) 1.87 (s, 3H) 3.80 (dq, $J_1=14.12\text{Hz}$; $J_2=7.34\text{Hz}$, 1H) 3.97 (dq, $J_1=14.12\text{Hz}$; $J_2=7.34\text{Hz}$, 1H) 7.08 (dd, $J_1=6.97$; $J_2=1.83\text{Hz}$, 1H) 7.98 (m, 1H) 8.32 (d, $J=7.34\text{Hz}$, 1H) 8.38 (s, 1H) 8.40 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 8.73 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H)。

實施例P10：2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P10）的製備



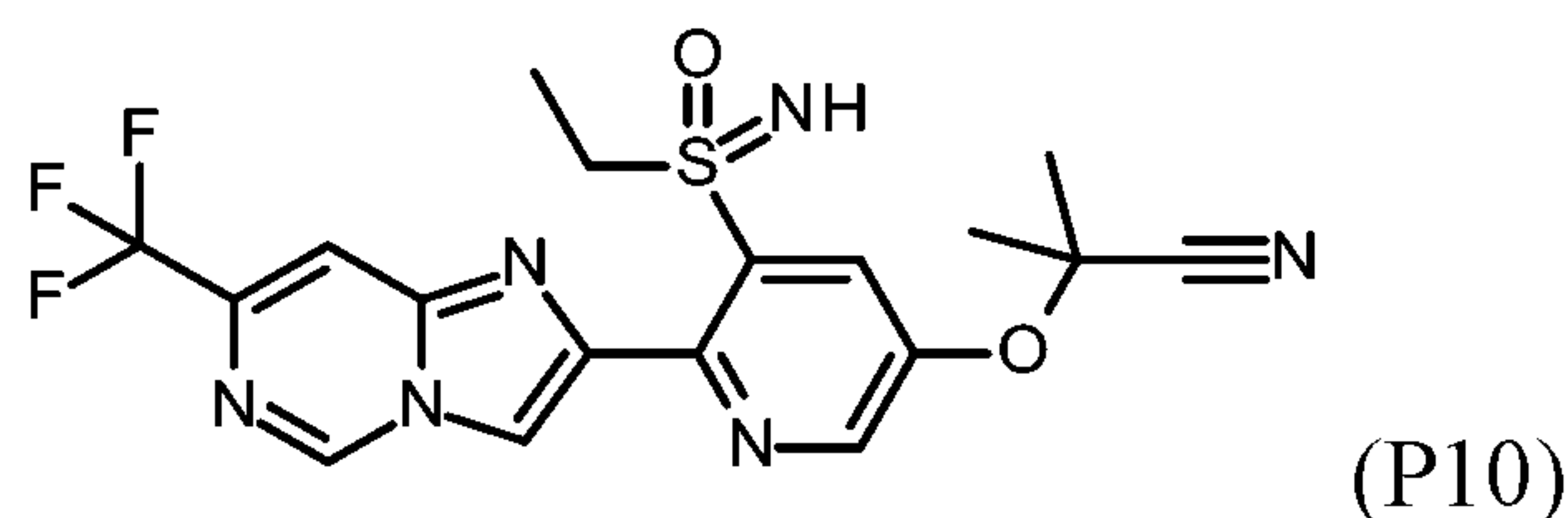
步驟1：2-[[5-乙基氫硫基-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物I29）的製備



【0334】 在實施例P9的步驟5中所描述的相同條件下，將2-[[6-(2-溴乙醯基)-5-乙基氫硫基-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（如上實施例P9的步驟4中所描述製備的化合物I26）和6-(三氟甲基)嘧啶-4-胺（根據WO 2016071214製備）混合得到所希望的化合物。

【0335】 ^1H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.44 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.81 (s, 6H) 3.04 (q, $J=7.34\text{Hz}$, 2H) 7.67 (s, 1H) 8.05 (s, 1H) 8.34 (s, 1H) 8.45 (s, 1H) 9.18 (s, 1H)。

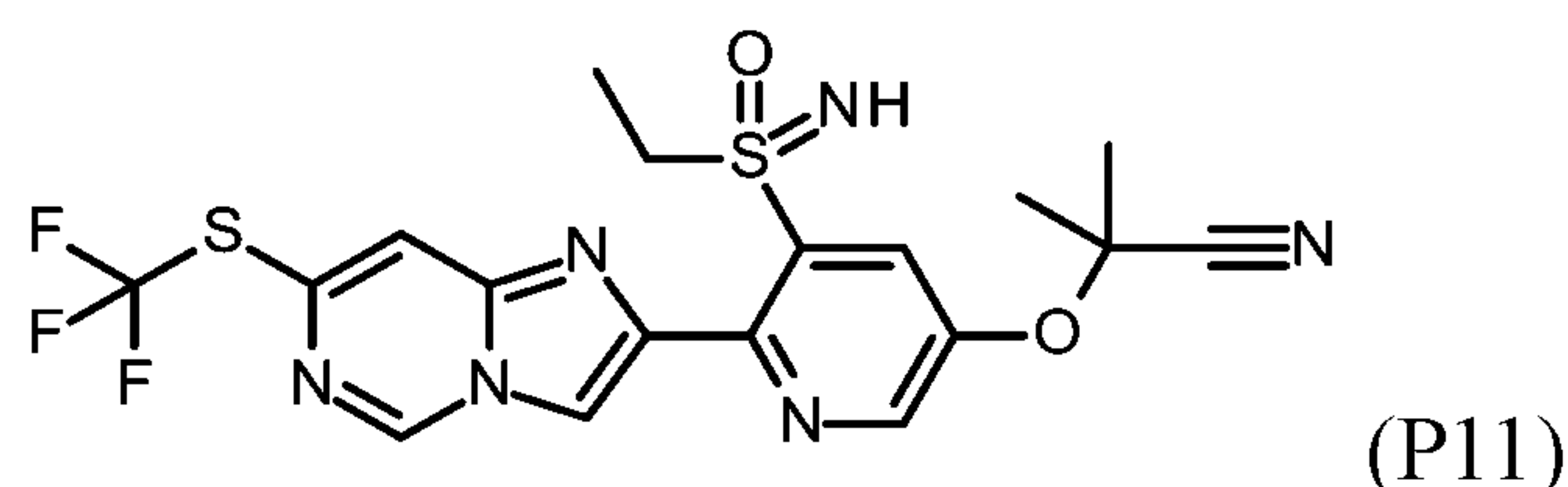
步驟2：2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P8）的製備



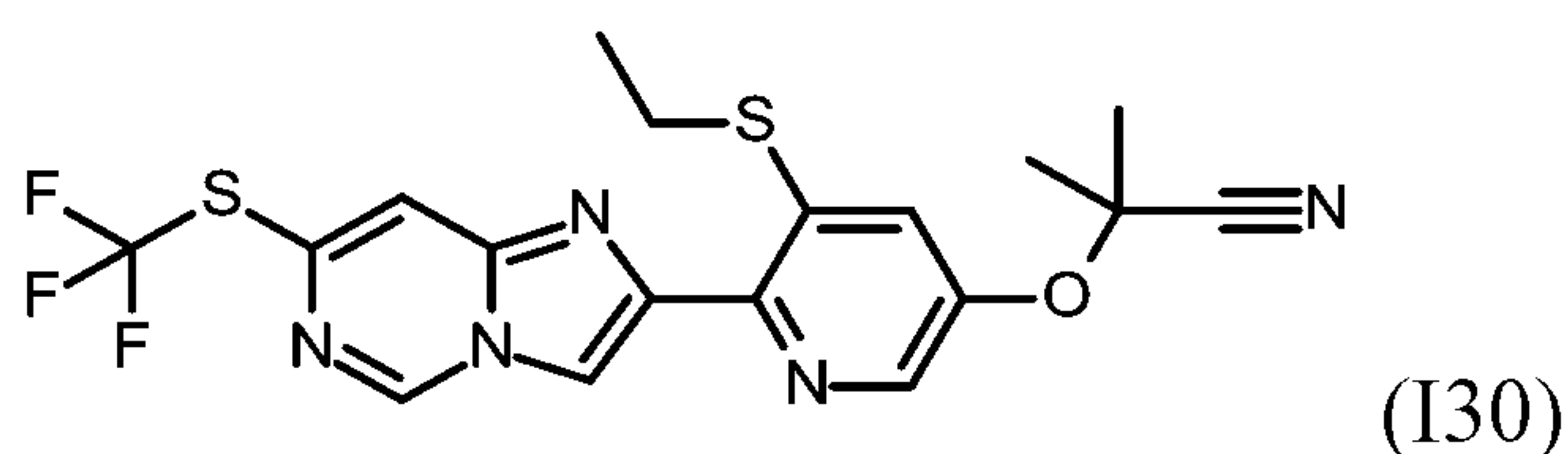
【0336】 在如實施例P9的步驟6中所描述的相同條件下處理2-[[5-乙基氫硫基-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（如上所描述製備的化合物I28）以給出所希望的化合物。

【0337】 ^1H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.40 (t, $J=7.52\text{Hz}$, 3H) 1.87 (s, 3H) 1.89 (s, 3H) 3.80-4.00 (m, 2H) 7.99 (s, 1H) 8.41 (s, 1H) 8.75 (s, 1H) 9.19 (s, 1H)。

實施例P11：2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-(三氟甲基氫硫基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P11）的製備



步驟1：2-[[5-乙基氫硫基-6-[7-(三氟甲基氫硫基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物I30）的製備

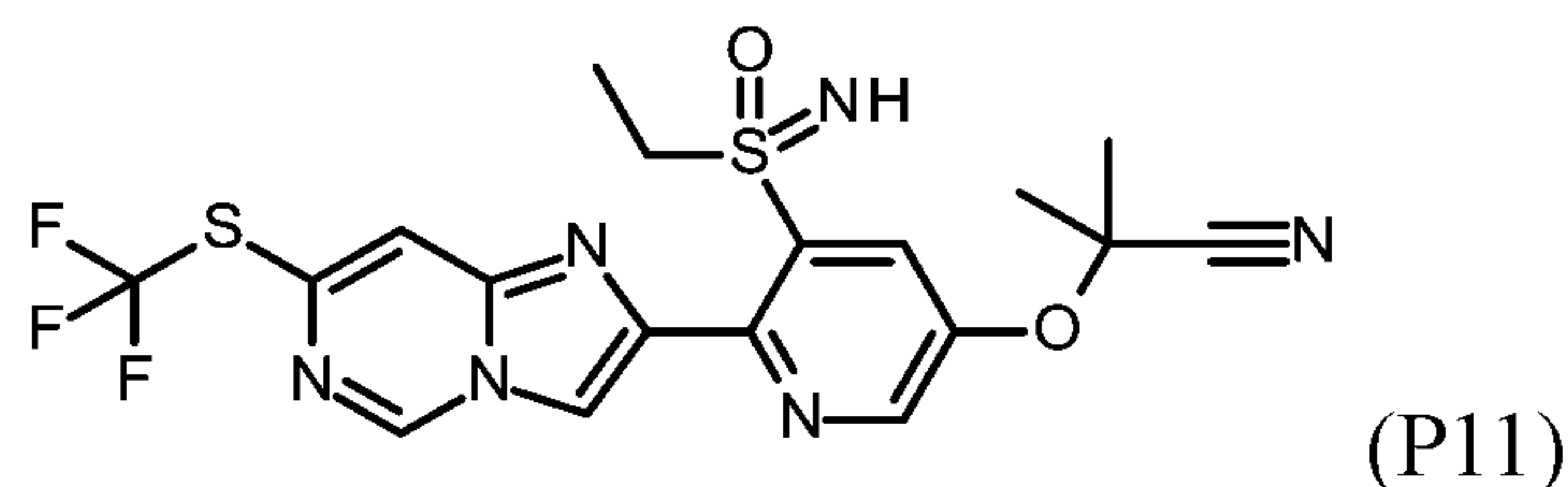


【0338】 在實施例P9的步驟5中所描述的相同條件下，將2-[[6-(2-溴乙醯基)-5-乙基氫硫基-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（如上實施例P9的步驟4中所描述

製備的化合物I26) 和6-(三氟甲基氫硫基)嘧啶-4-胺 (根據WO 2016071214製備) 混合得到所希望的化合物。

【0339】 ^1H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.44 (m, 3H) 1.82 (s, 6H) 3.05 (m, 2H) 7.66 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H) 8.02 (s, 1H) 8.34 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H) 8.39 (s, 1H) 9.10 (s, 1H)。

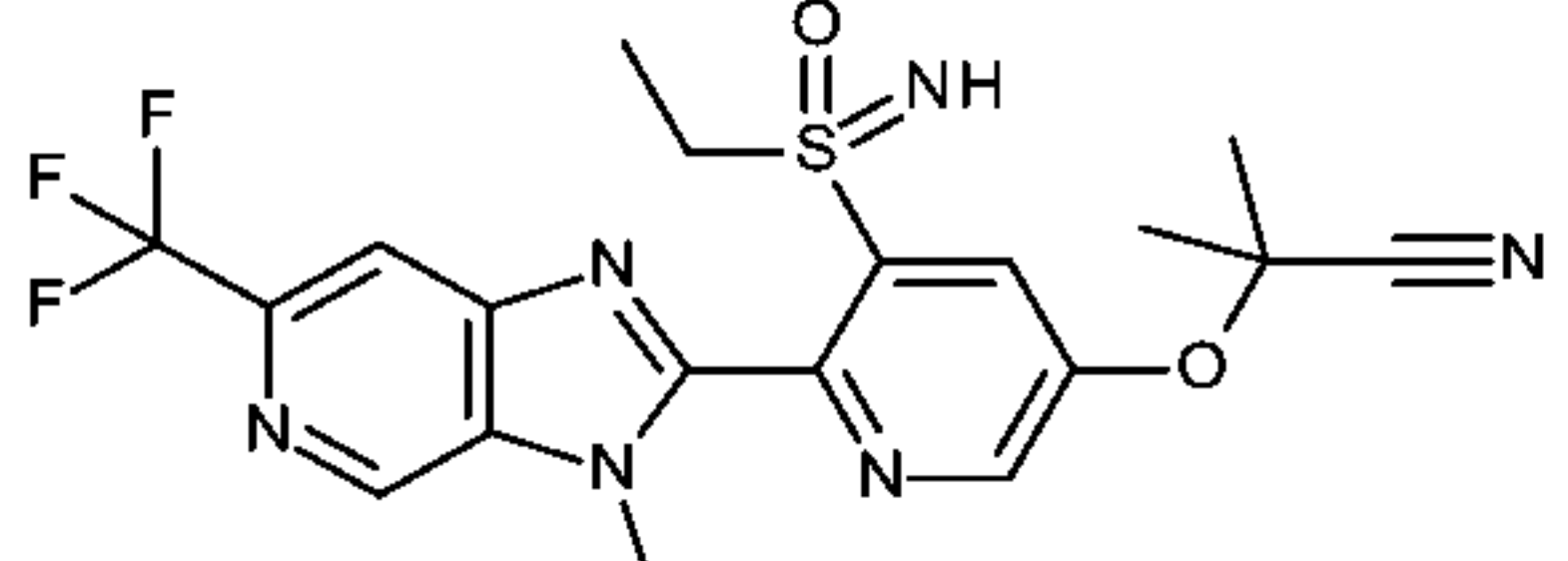
步驟2: 2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-(三氟甲基氫硫基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈 (化合物P11) 的製備

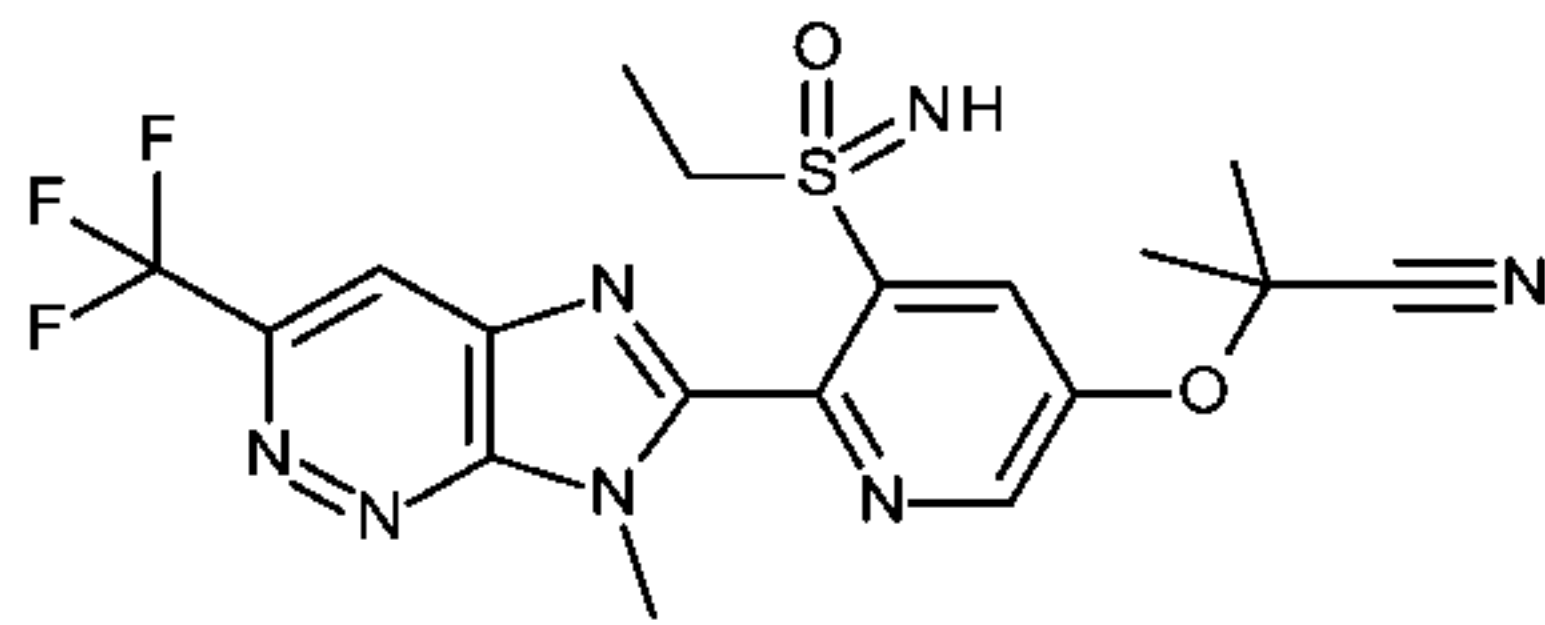
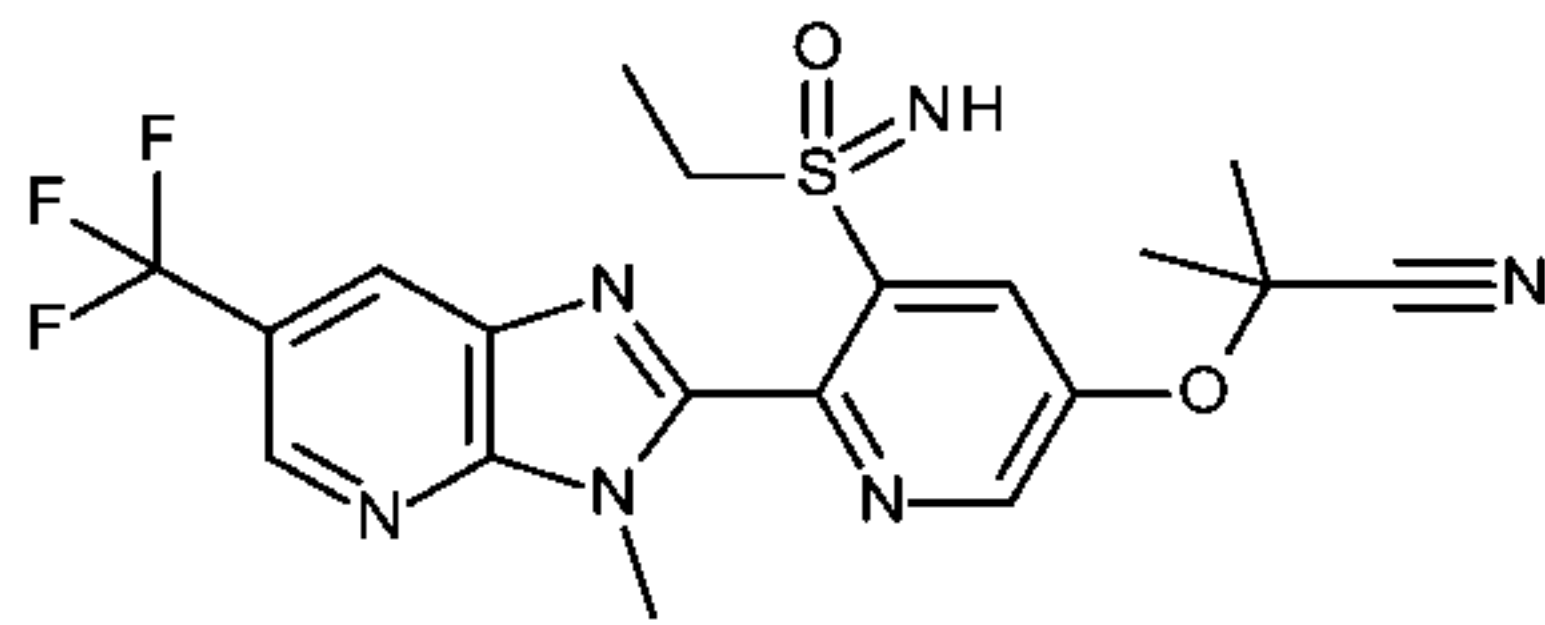


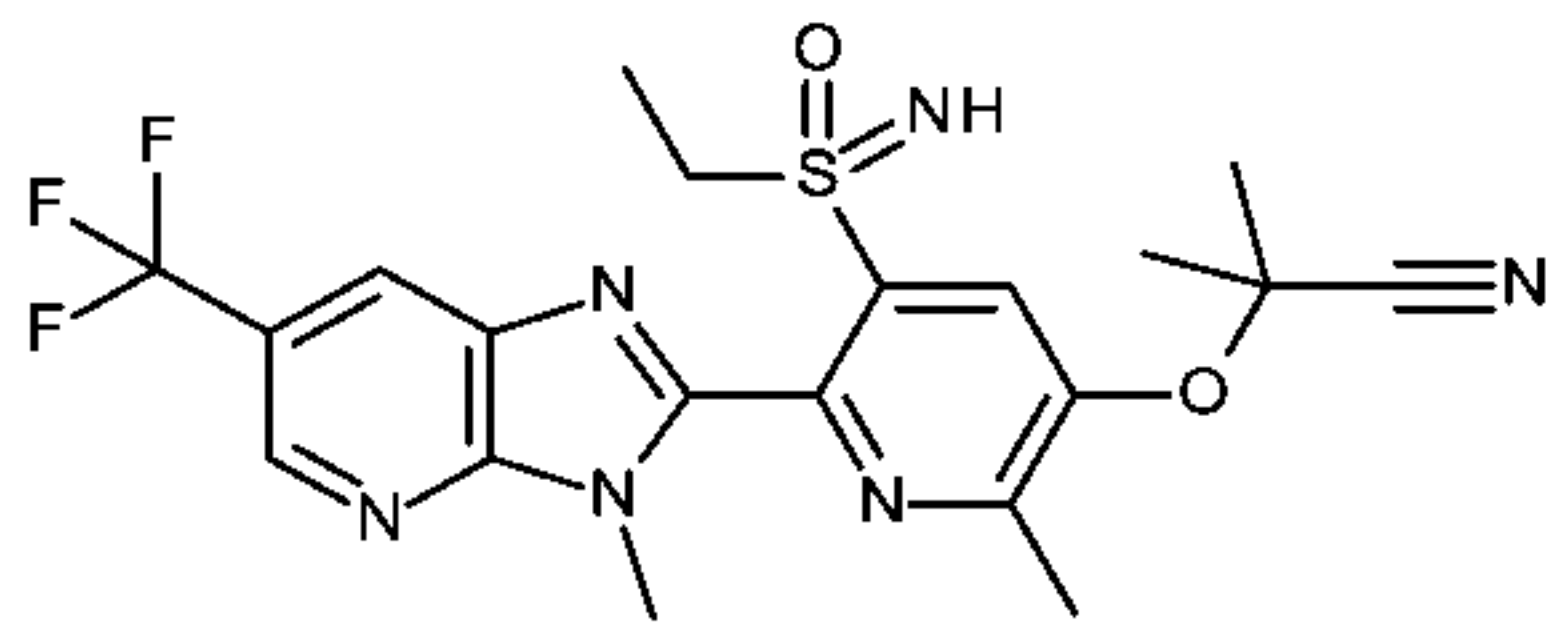
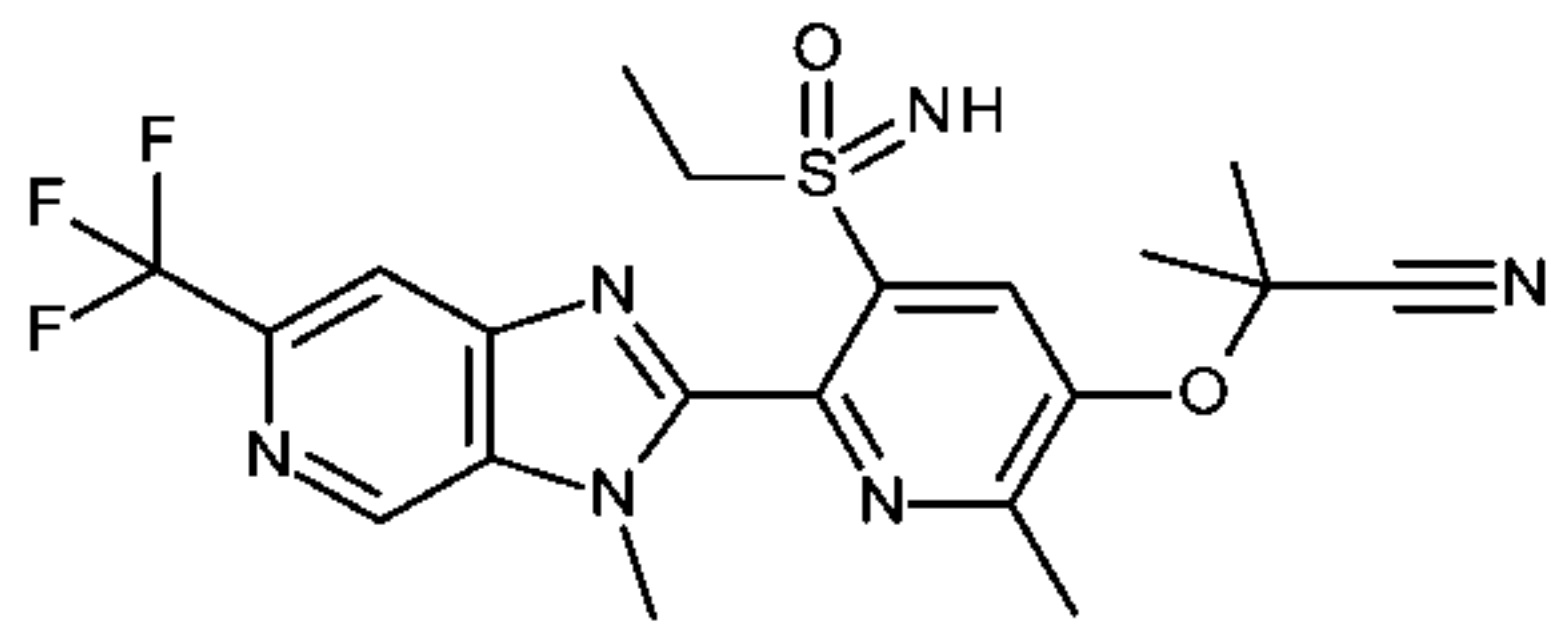
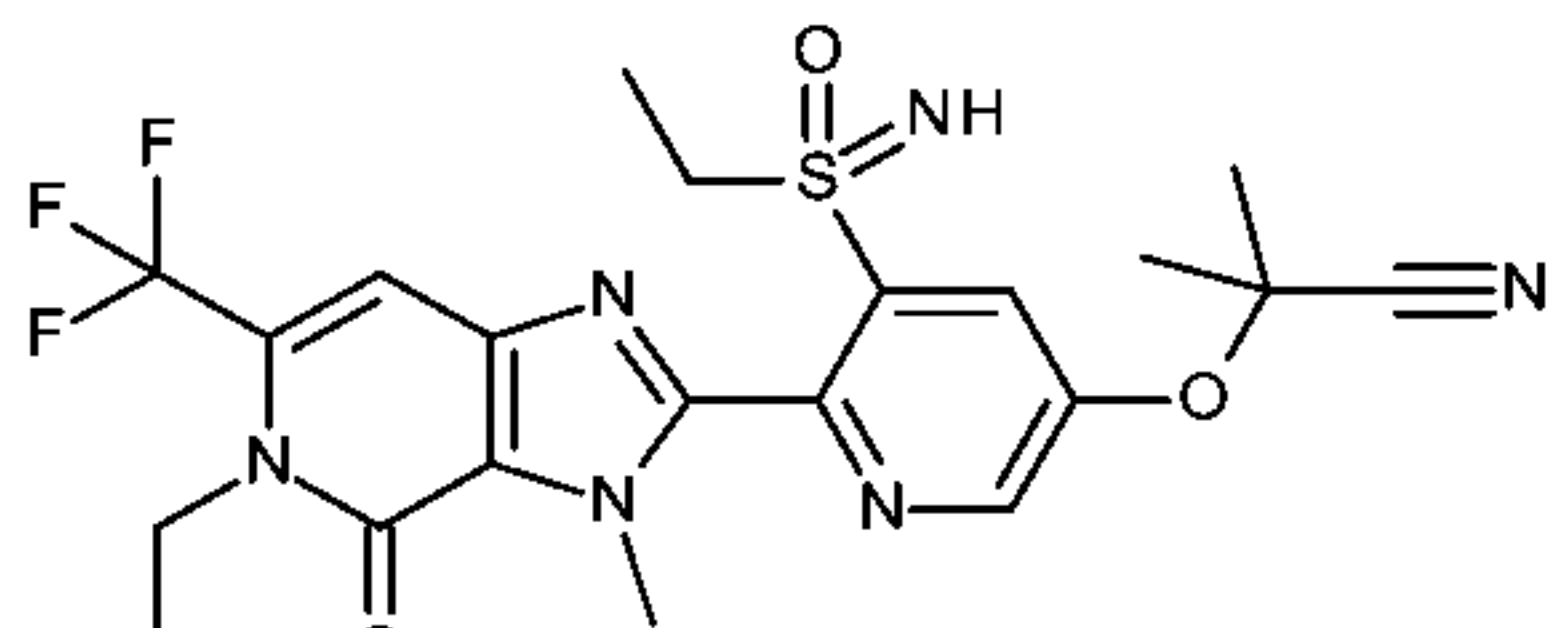
【0340】 在如實施例P9的步驟6中所描述的共同條件下處理2-[[5-乙基氫硫基-6-[7-(三氟甲基氫硫基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈 (如上所描述製備的化合物I30) 以給出所希望的化合物。

【0341】 ^1H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.38 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.88 (2*s, 2*3H) 3.74 - 4.00 (m, 2H) 7.94 (s, 1H) 8.35 (d, $J=0.73\text{Hz}$, 1H) 8.41 (d, $J=2.93\text{Hz}$, 1H) 8.75 (d, $J=2.93\text{Hz}$, 1H) 9.11 (d, $J=1.47\text{Hz}$, 1H)。

[表P]: 式 (I) 和 (Ia) 之化合物的實施例

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)	^1H NMR
			R_t (min) ⁺	[M+H] ⁺ (測量的)	方法		
P1	2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)		0.86	453	1	90-99	1)

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)	¹ H NMR
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法		
	咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈						
P2	2-[[5-(乙基磺酰亞胺基)-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]嗒吡啶-6-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈		0.89	454	1	197-199	2)
P3	2-[[5-(乙基磺酰亞胺基)-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈		0.93	453	1	155-156	

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)	¹ H NM R
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法		
P4	2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈		0.97	467	1	177-179	
P5	2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈		0.91	467	1	185-187	
P6	2-[[6-[5-乙基-3-甲基-4-側氧基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-5-(乙基磺		0.93	497	4	110-112	

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)	¹ H NM R
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法		
	醯亞胺基)-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈						
P7	2-[[6-[5-環丙基-3-甲基-4-側氧基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-5-(乙基磺醯亞胺基)-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈		0.92	509	4	211-213	
P8	2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈		0.88	438	1		3)
P9	2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈		0.93	489	1	75-80	4)

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)	¹ H NMR
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法		
	基)-6-[7-(1,1,2,2,2-五氟乙基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈						
P10	2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈		0.84	439	1	75-78	5)
P11	2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-(三氟甲基氫硫基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈		0.89	471	1		6)

¹) ¹H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.40 (t, *J*=7.34Hz, 3H) 1.93 (s, 6H)

3.89-3.74 (m, 2H) 3.90 (s, 3H) 8.12 (s, 1H) 8.40 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 8.81 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 8.99 (s, 1H)

²⁾ ¹H NMR (400 MHz, 二甲基亞砷-d₆) δ ppm 1.18 (t, $J=7.52\text{Hz}$, 3H) 1.60 (s, 6H) 3.69-3.49 (m, 2H) 3.91 (s, 3H) 4.63 (s, 1H) 8.30 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 8.74 (s, 1H) 8.93 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H)

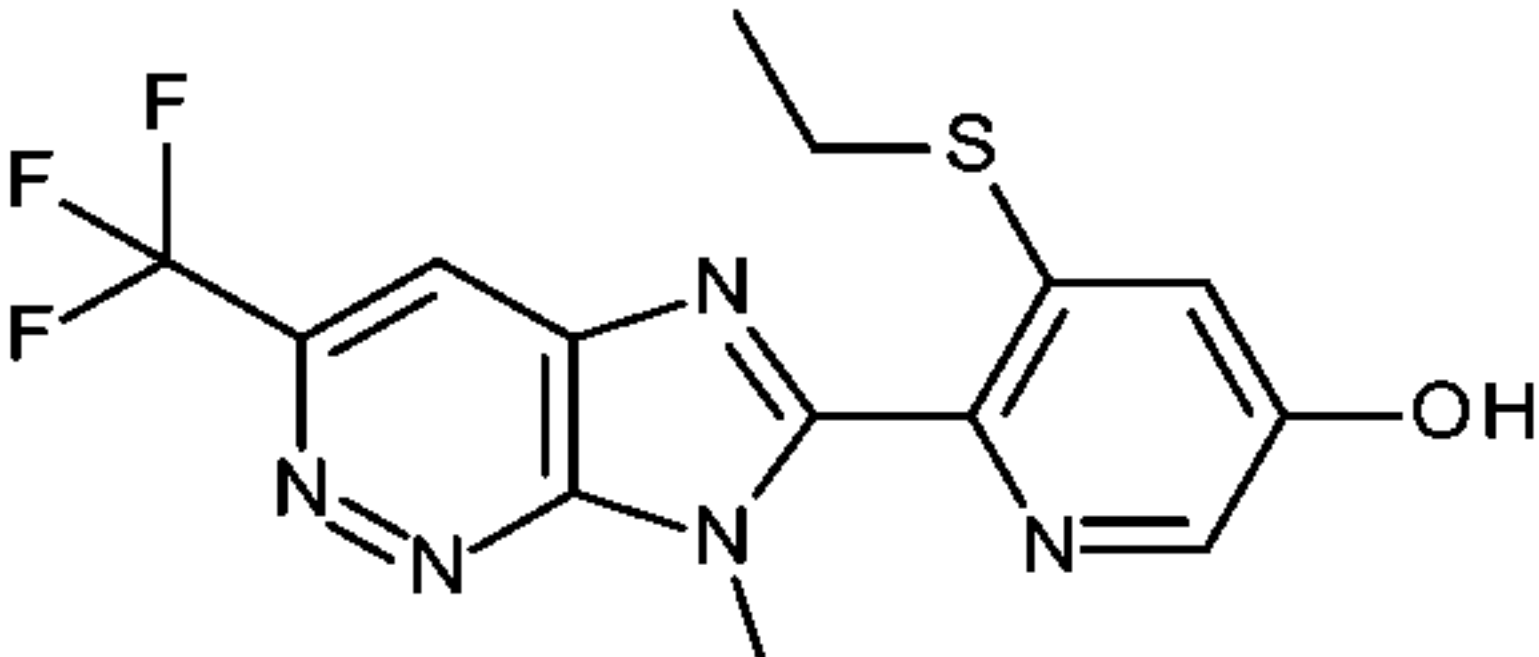
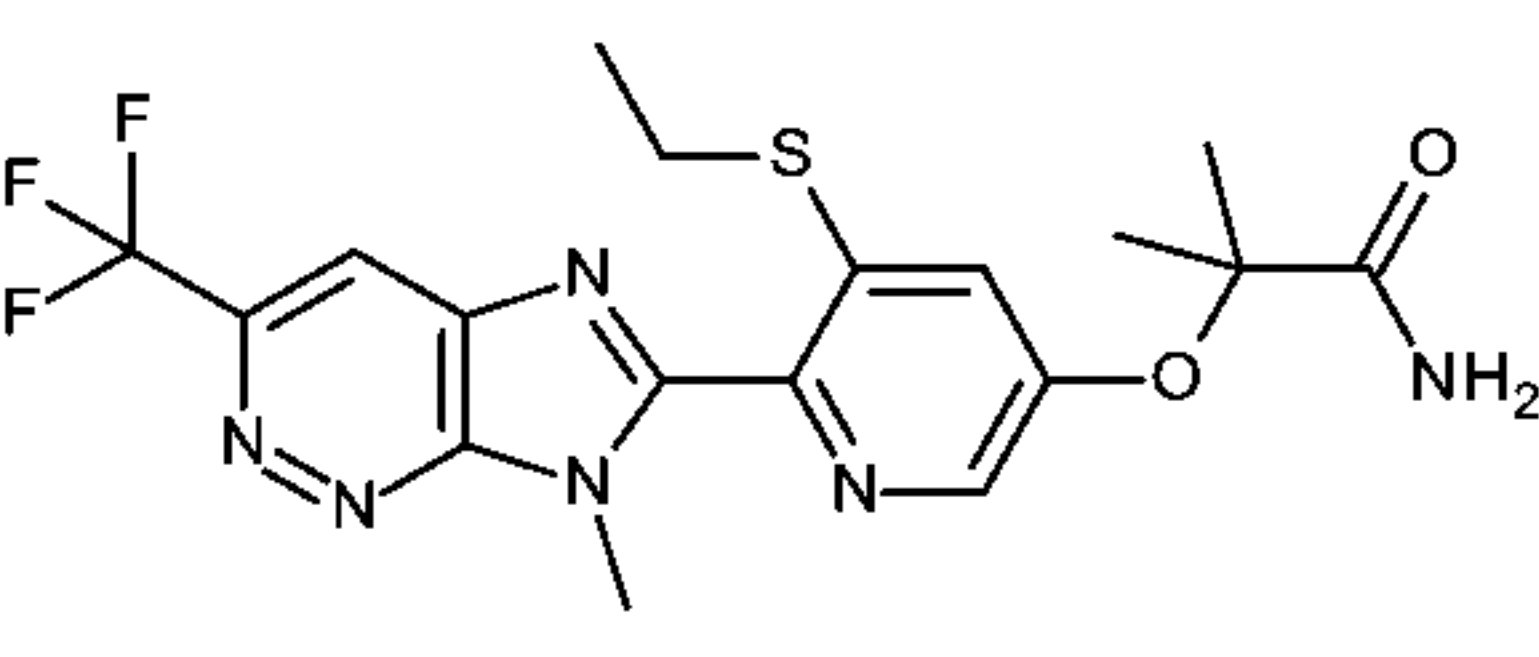
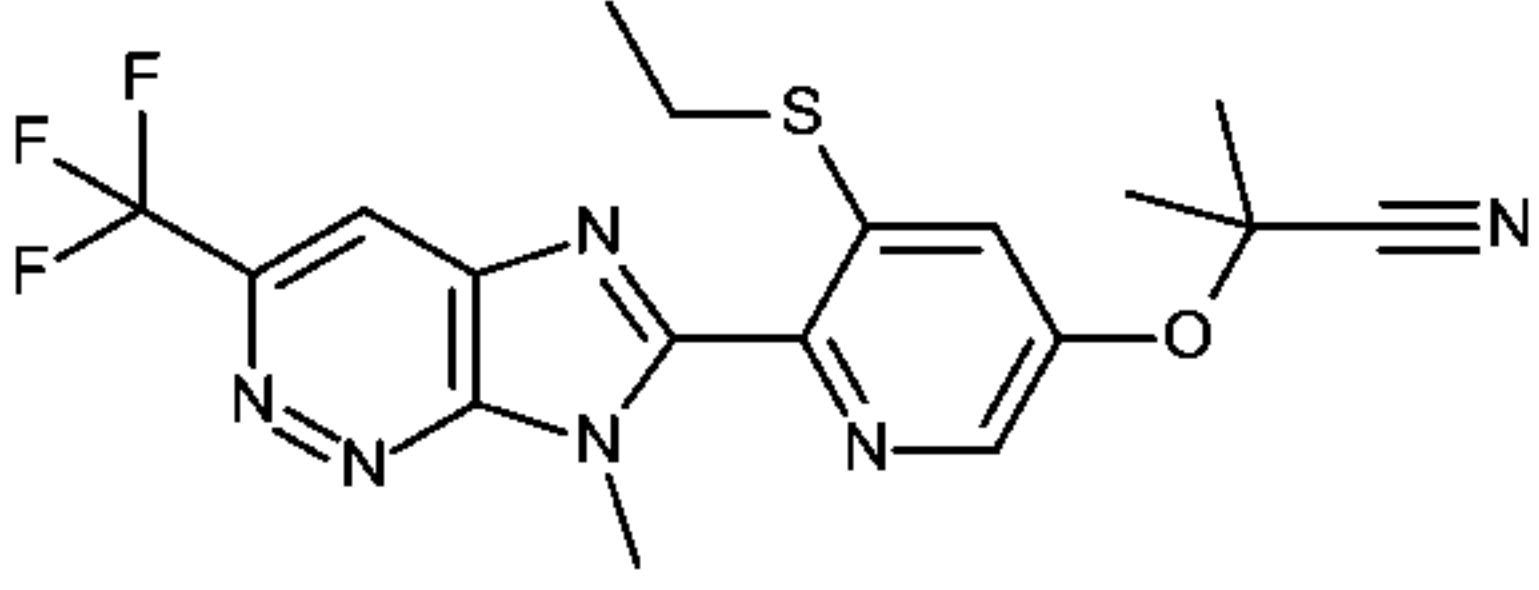
³⁾ ¹H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.37 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.85 (s, 3H) 1.87 (s, 3H) 3.80 (dq, $J_1=14.12\text{Hz}$; $J_2=7.34\text{Hz}$, 1H) 3.97 (dq, $J_1=14.12\text{Hz}$; $J_2=7.34\text{Hz}$, 1H) 7.08 (dd, $J_1=6.97$; $J_2=1.83\text{Hz}$, 1H) 7.98 (m, 1H) 8.32 (d, $J=7.34\text{Hz}$, 1H) 8.38 (s, 1H) 8.40 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 8.73 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H)

⁴⁾ ¹H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.40 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.87 (s, 3H) 1.89 (s, 3H) 3.81-4.00 (m, 2H) 8.03 (s, 1H) 8.40 (s, 1H) 8.42 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 8.75 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 9.20 (s, 1H)

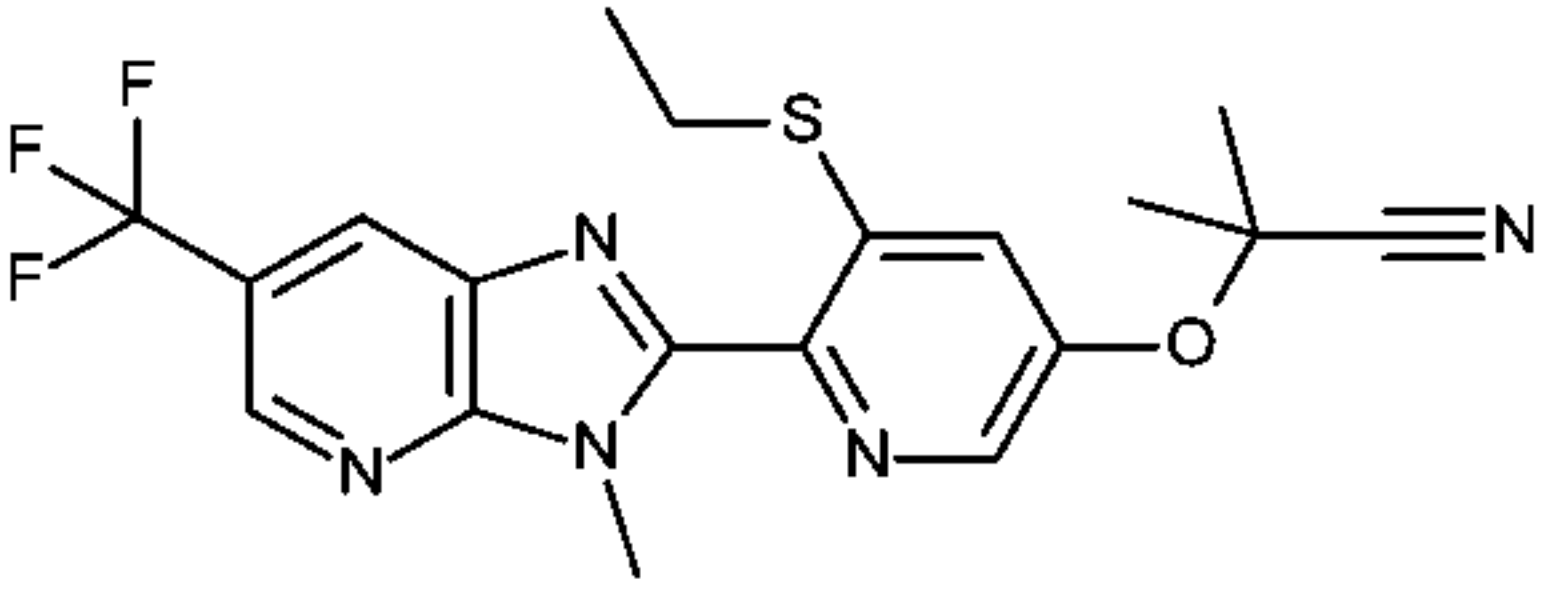
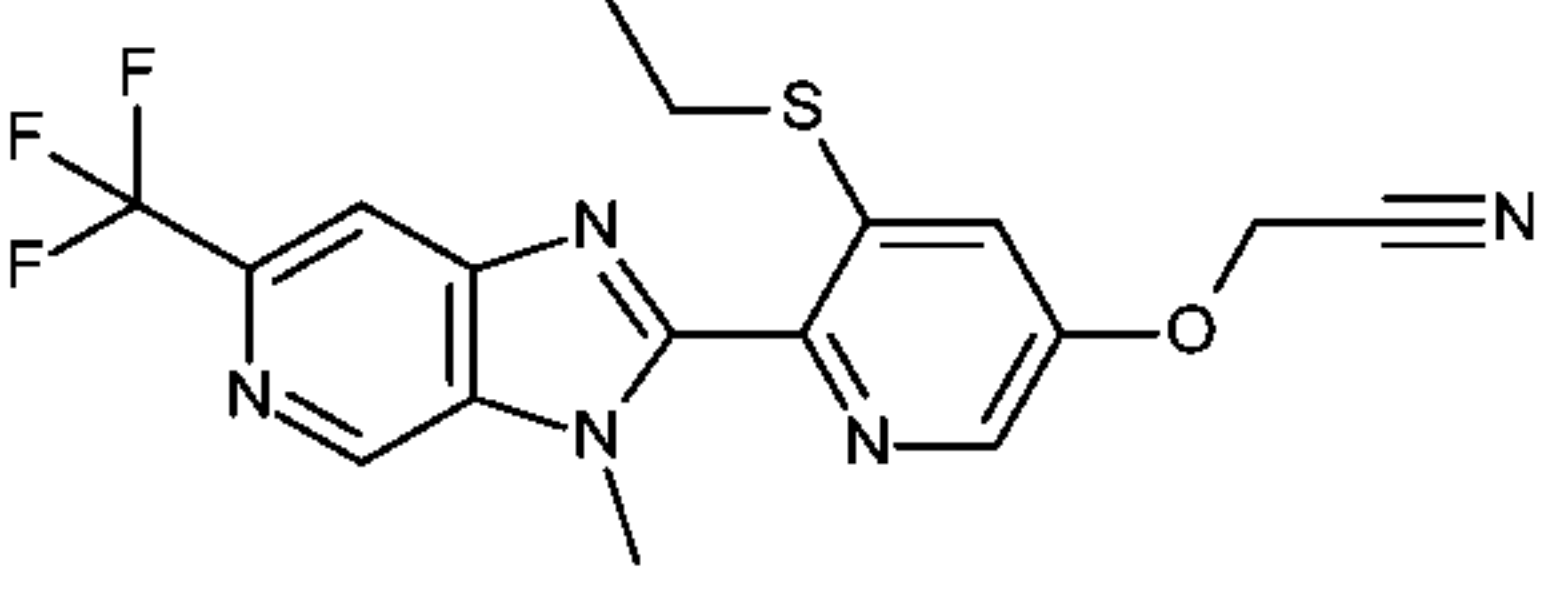
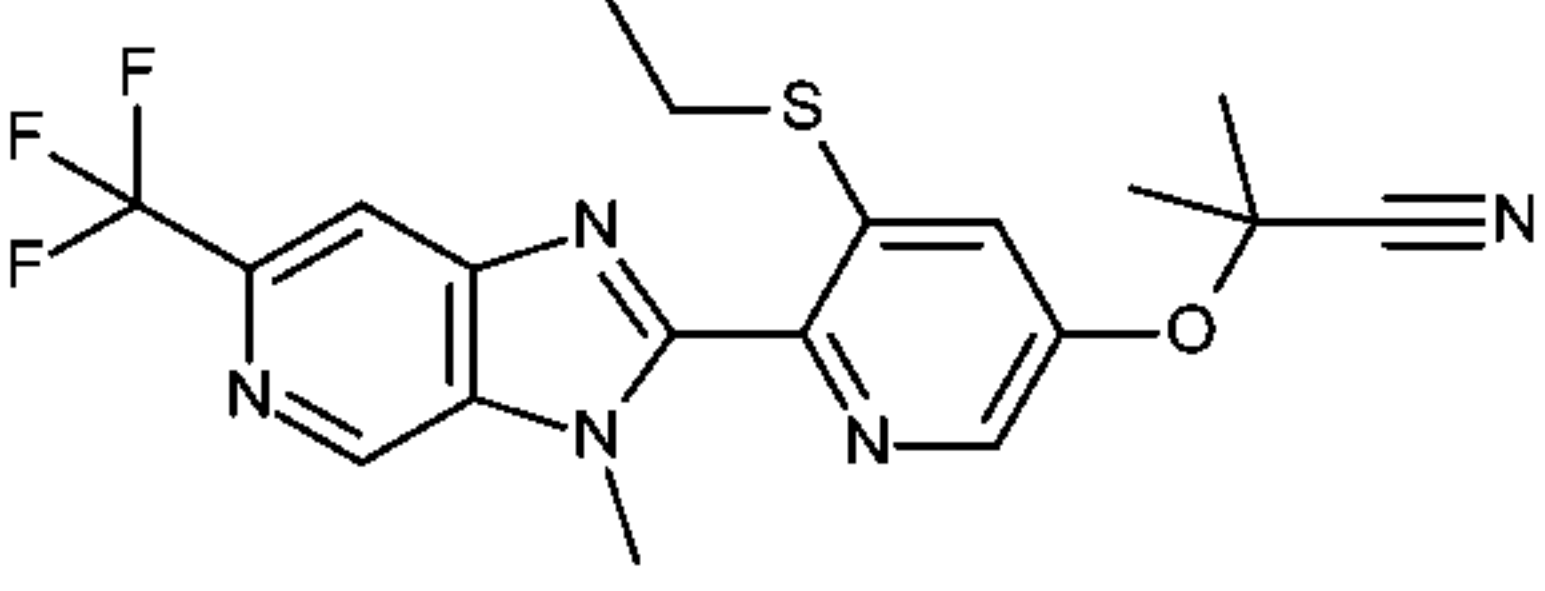
⁵⁾ ¹H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.40 (t, $J=7.52\text{Hz}$, 3H) 1.87 (s, 3H) 1.89 (s, 3H) 3.80-4.00 (m, 2H) 7.99 (s, 1H) 8.41 (s, 1H) 8.75 (s, 1H) 9.19 (s, 1H)

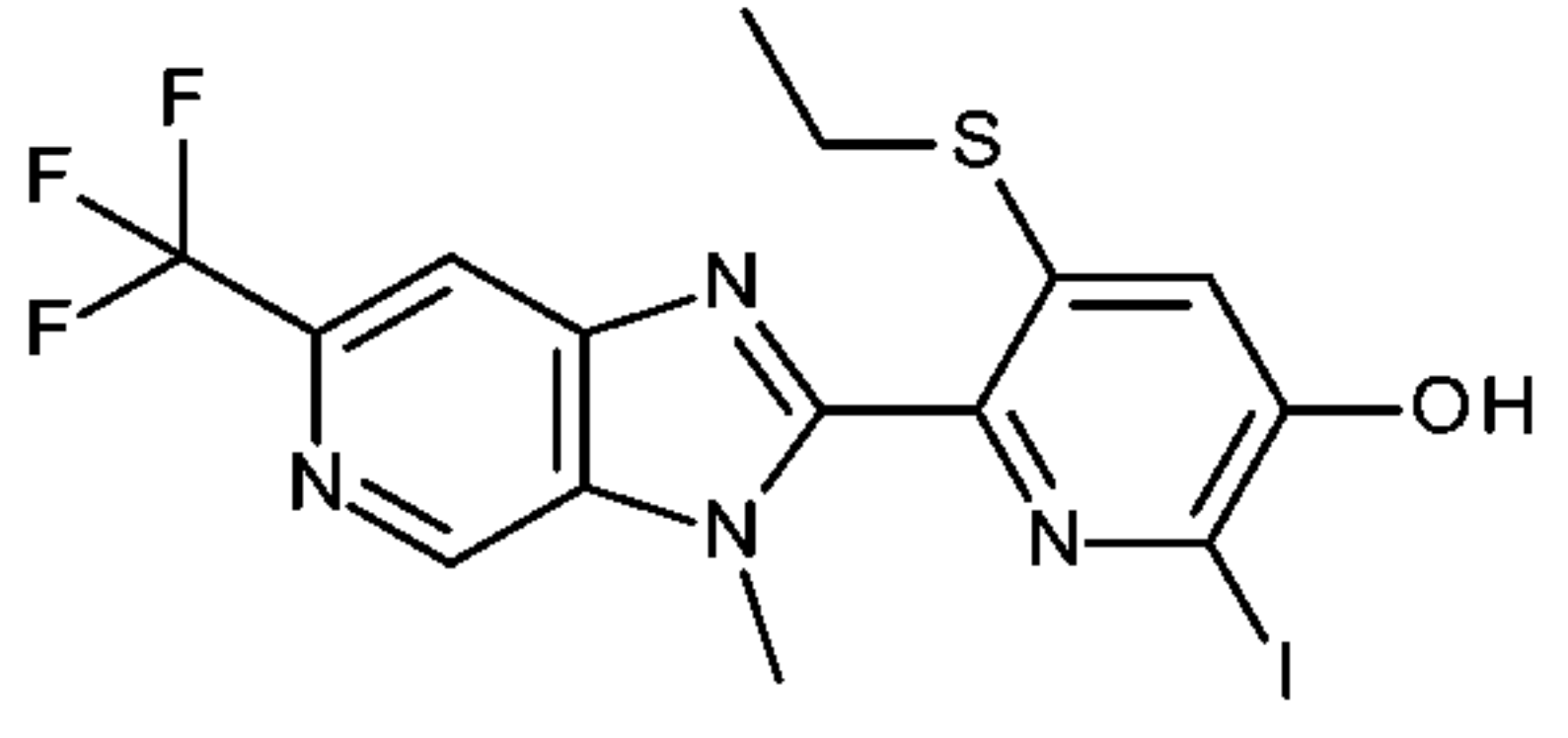
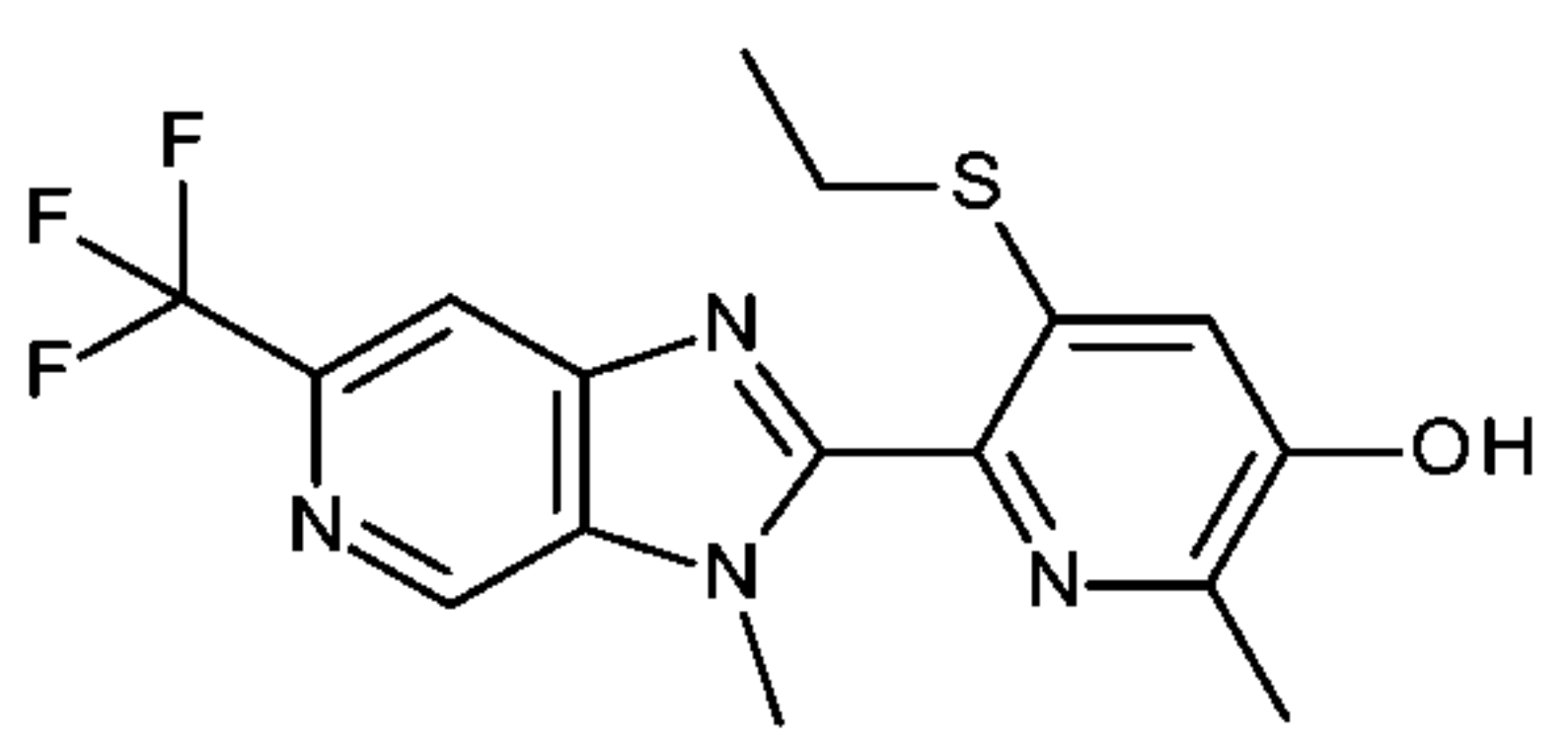
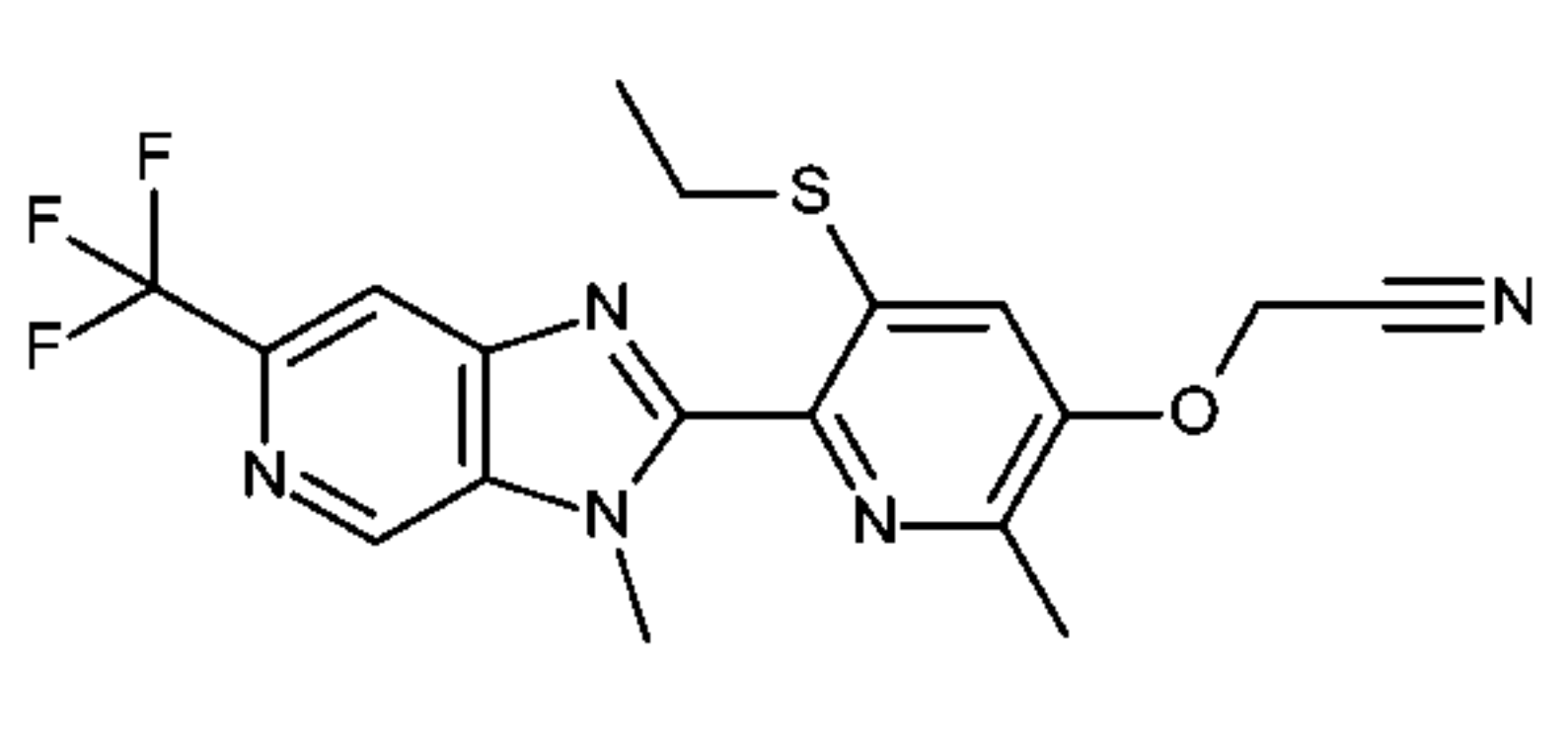
⁶⁾ ¹H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.38 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.88 (2*s, 2*3H) 3.74 - 4.00 (m, 2H) 7.94 (s, 1H) 8.35 (d, $J=0.73\text{Hz}$, 1H) 8.41 (d, $J=2.93\text{Hz}$, 1H) 8.75 (d, $J=2.93\text{Hz}$, 1H) 9.11 (d, $J=1.47\text{Hz}$, 1H)

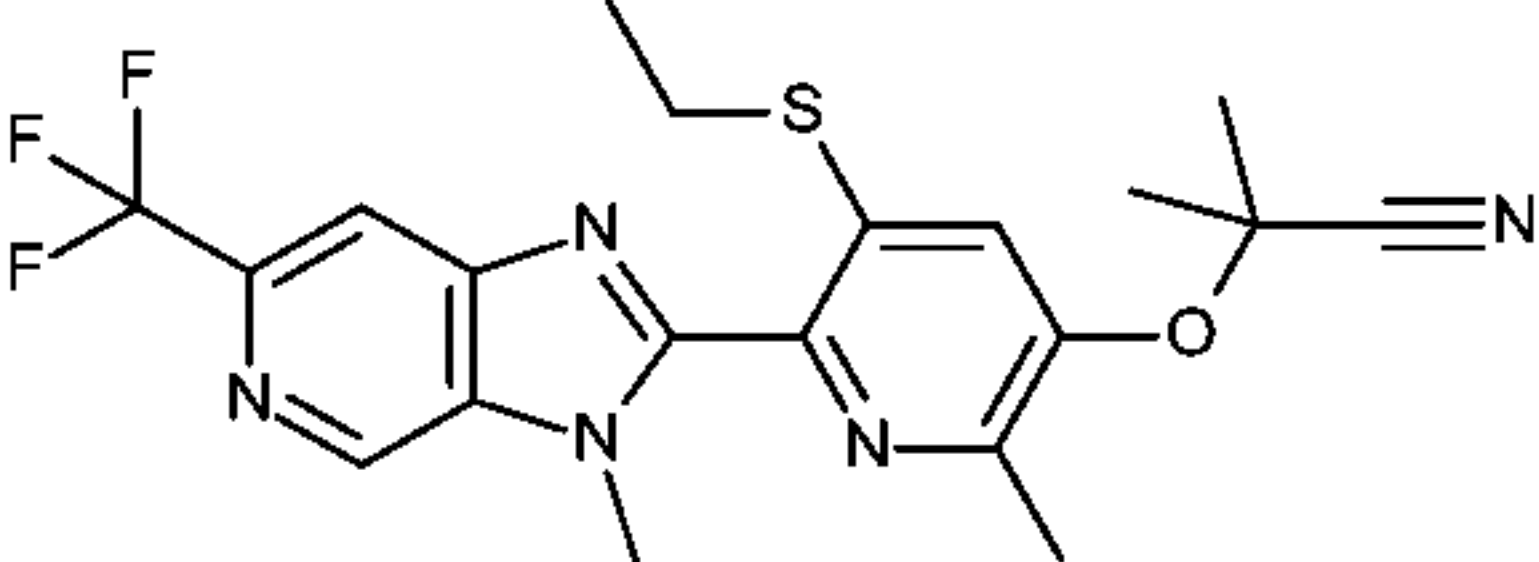
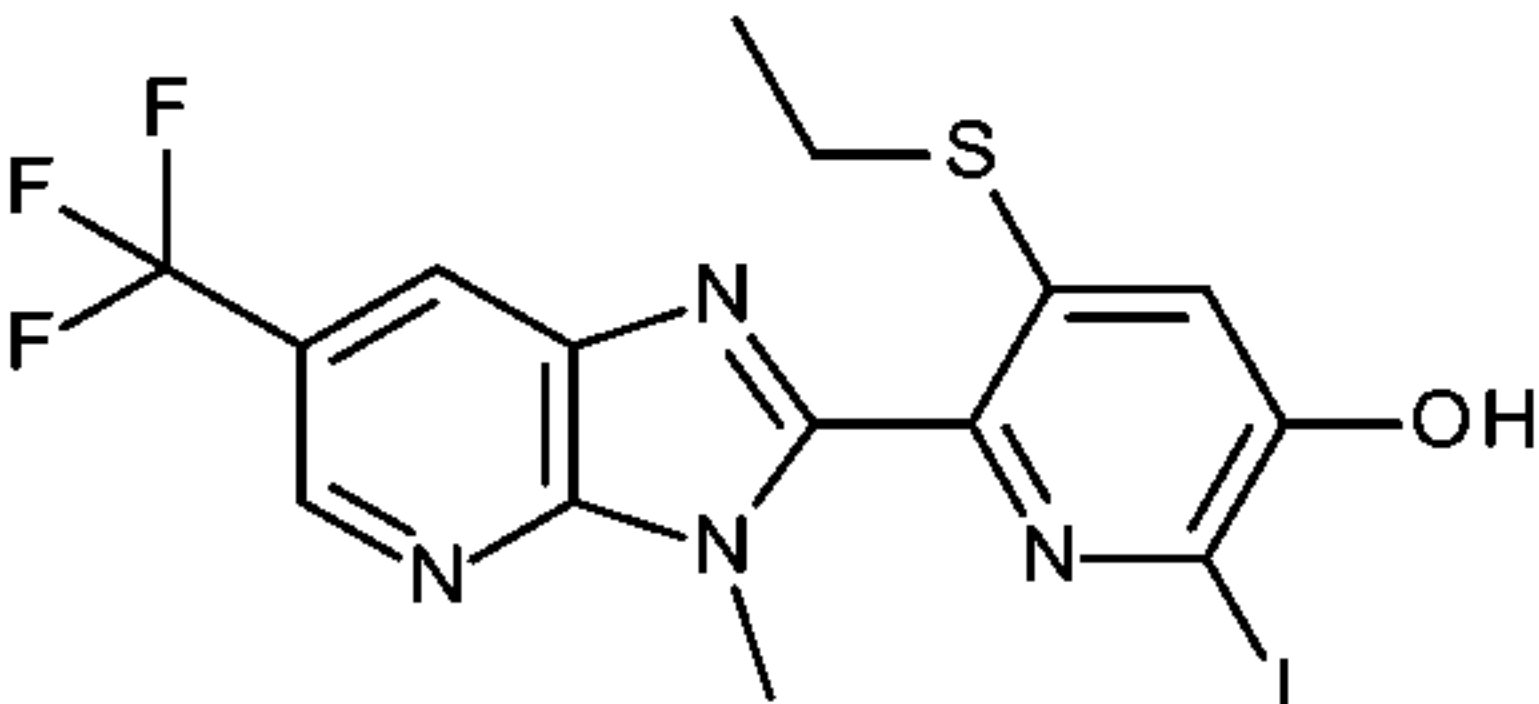
[表I]：式(II)、(III)、(V)、(Va)、(Vb)、(Vc)、(VII)、(XXII)、(XXIII)、(XXIV)、(XXV-c)、(XXV-a)、(XXVI)、(XXVIII)、(XXIX-a)和(XXIX-c)之中間體化合物的實施例

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)	¹ H NMR
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法		
I1	5-乙基氫硫基 -6-[7-甲基 -3-(三氟甲基) 咪唑并[4,5-c] 嗒吡啶-6-基]吡啶 -3-醇		0.86	356	1	216-218	1)
I2	2-[[5-乙基氫硫 基-6-[7-甲基 -3-(三氟甲基) 咪唑并[4,5-c] 嗒吡啶-6-基]-3- 吡啶基]氧 基]-2-甲基-丙 醯胺					163-165	
I3	2-[[5-乙基氫硫 基-6-[7-甲基		1.04	423	1		2)

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)	¹ H NMR
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法		
	-3-(三氟甲基) 咪唑并[4,5-c] 嘧啶-6-基]-3- 吡啶基]氧 基]-2-甲基-丙 腈						
I4	5-乙基氫硫基 -6-[3-甲基 -6-(三氟甲基) 咪唑并[4,5-b] 吡啶-2-基]吡啶 -3-醇		0.94	355	1	194-195	
I5	2-[[5-乙基氫硫 基-6-[3-甲基 -6-(三氟甲基) 咪唑并[4,5-b] 吡啶-2-基]-3- 吡啶基]氧基] 乙腈		1.01	394	1		

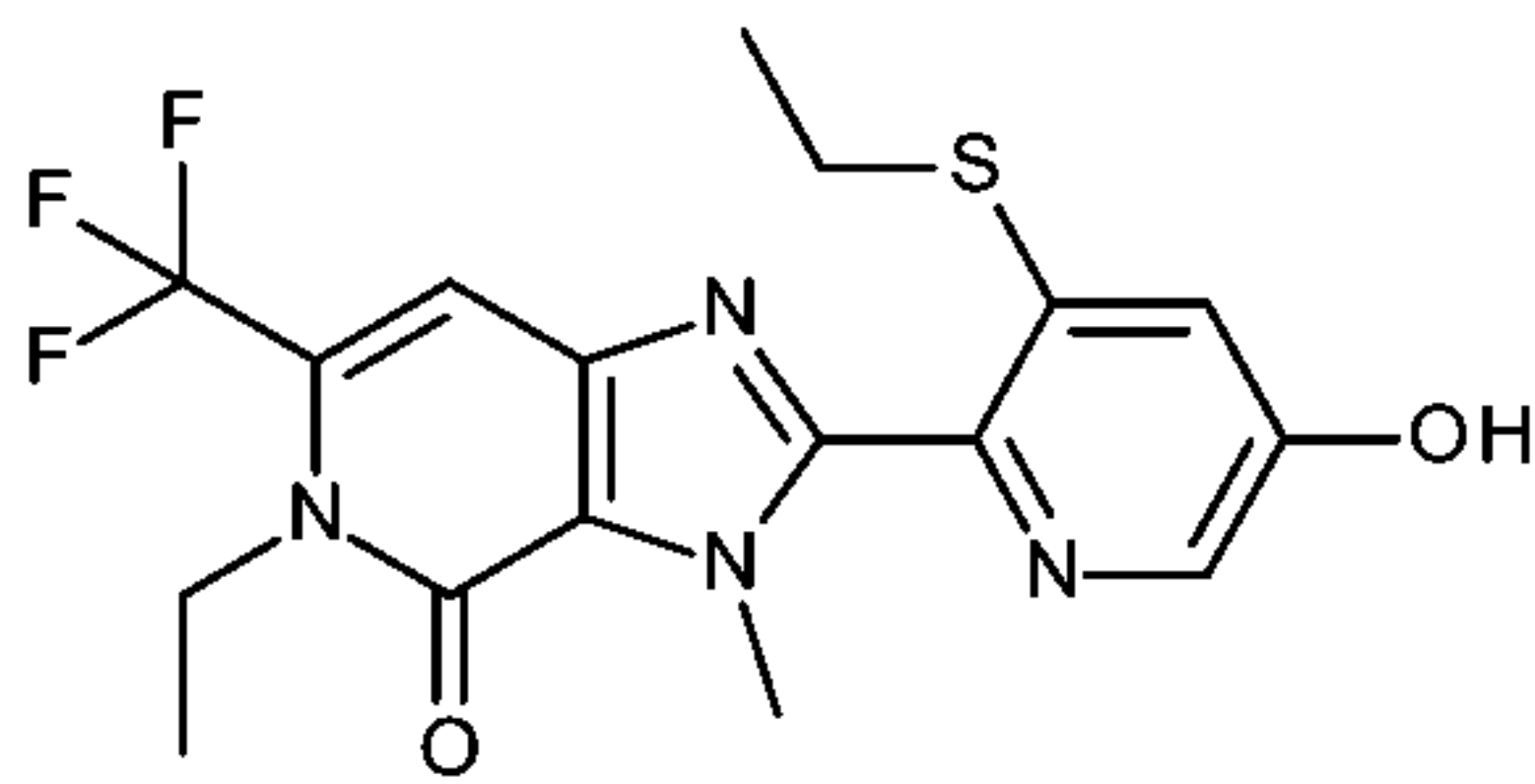
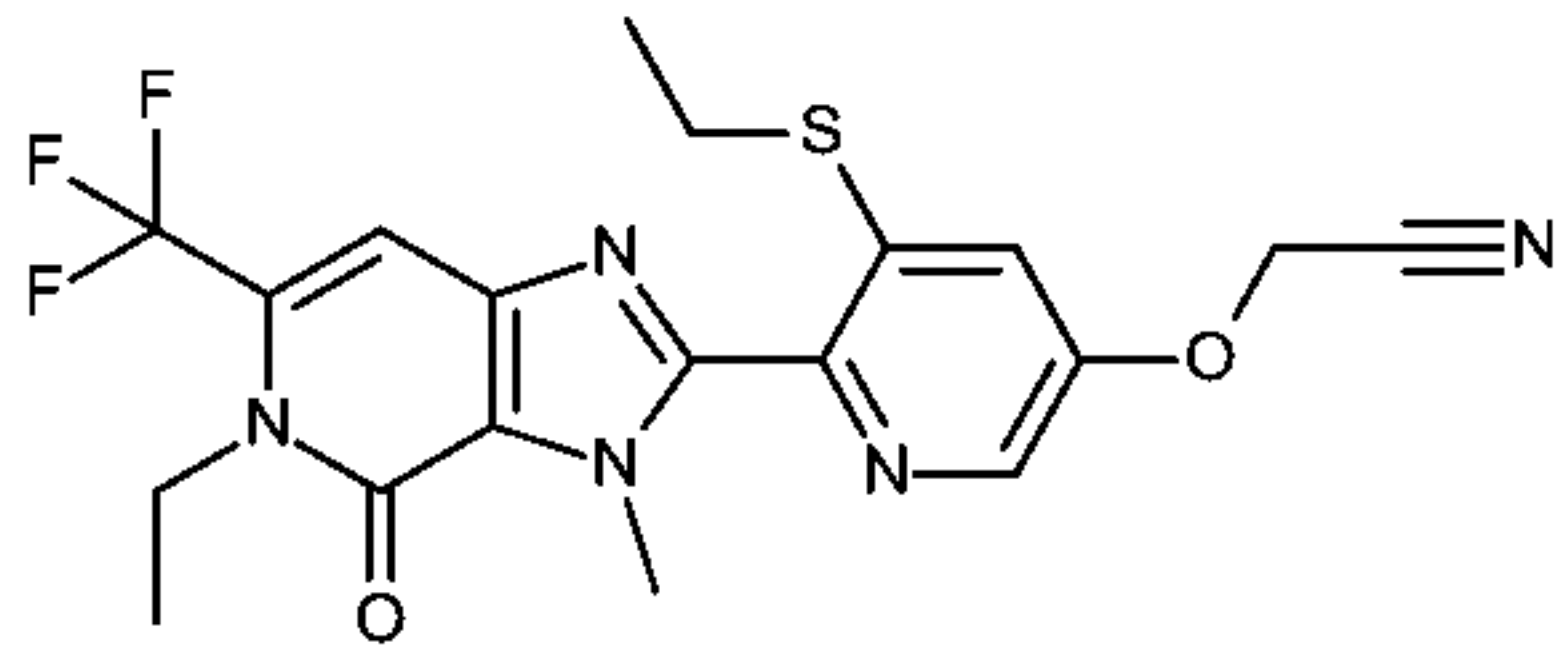
編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)	¹ H NMR
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法		
I6	2-[[5-乙基氫硫 基-6-[3-甲基 -6-(三氟甲基) 咪唑并[4,5-b] 吡啶-2-基]-3- 吡啶基]氧 基]-2-甲基-丙 腈		1.11	422	1		
I7	2-[[5-乙基氫硫 基-6-[3-甲基 -6-(三氟甲基) 咪唑并[4,5-c] 吡啶-2-基]-3- 吡啶基]氧基] 乙腈		0.94	394	1		
I8	2-[[5-乙基氫硫 基-6-[3-甲基 -6-(三氟甲基) 咪唑并[4,5-c] 吡啶-2-基]-3- 吡啶基]氧基] 乙腈		1.02	422	1		

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)	¹ H NMR
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法		
	吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈						
I9	5-乙基氫硫基-2-碘-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-醇		0.96	481	1		
I10	5-乙基氫硫基-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-醇		0.87	369	1		
I11	2-[[5-乙基氫硫基-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲		0.96	408	1		

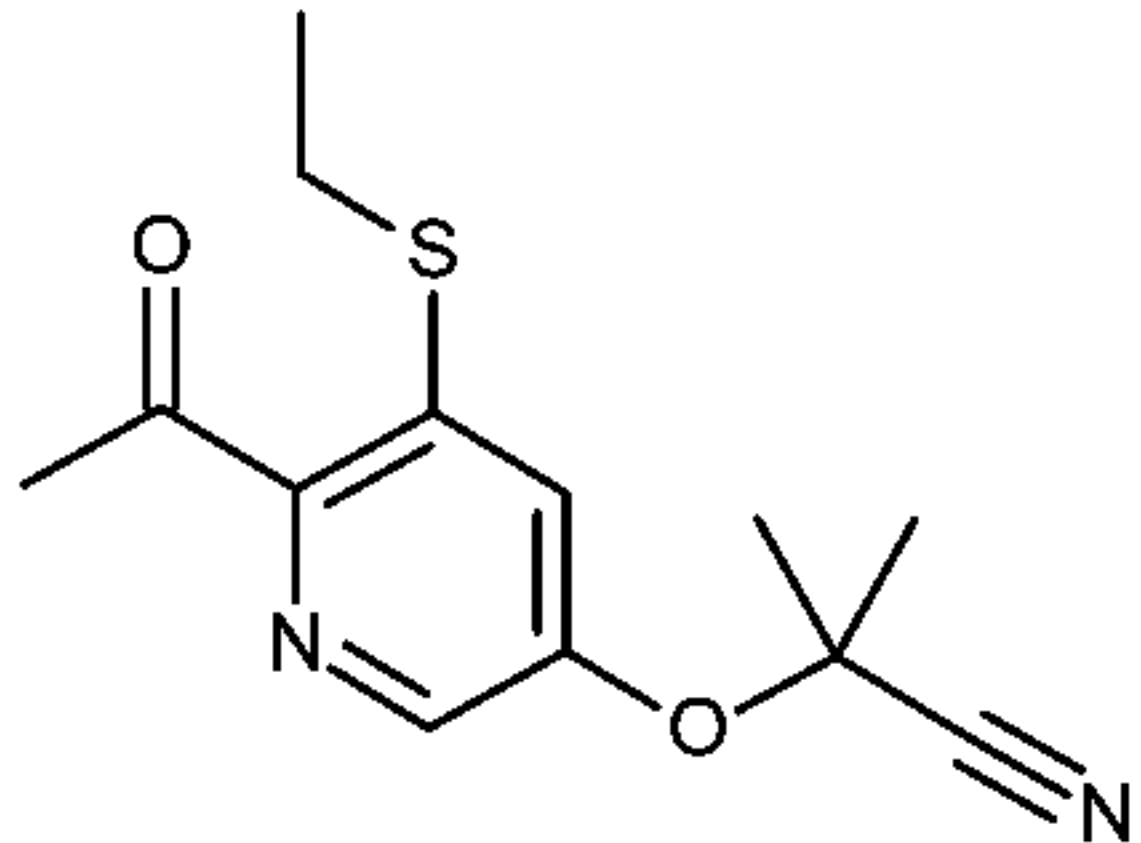
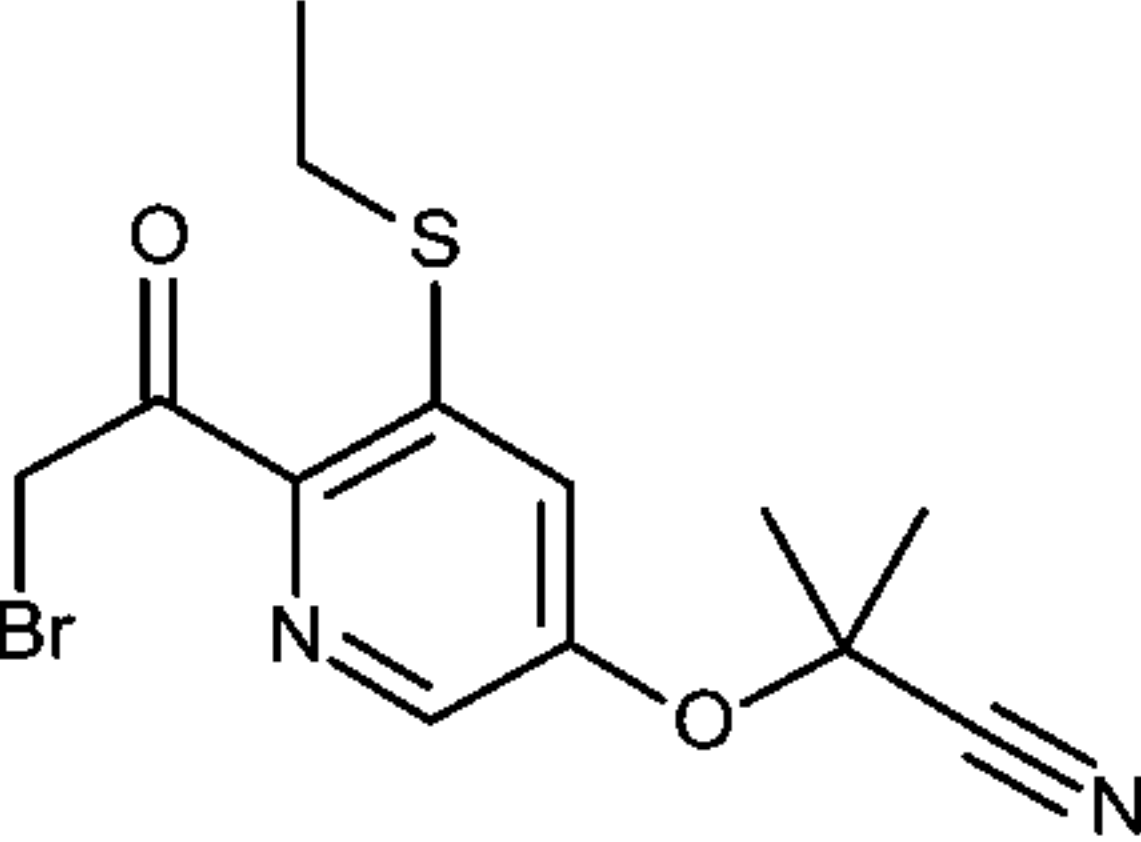
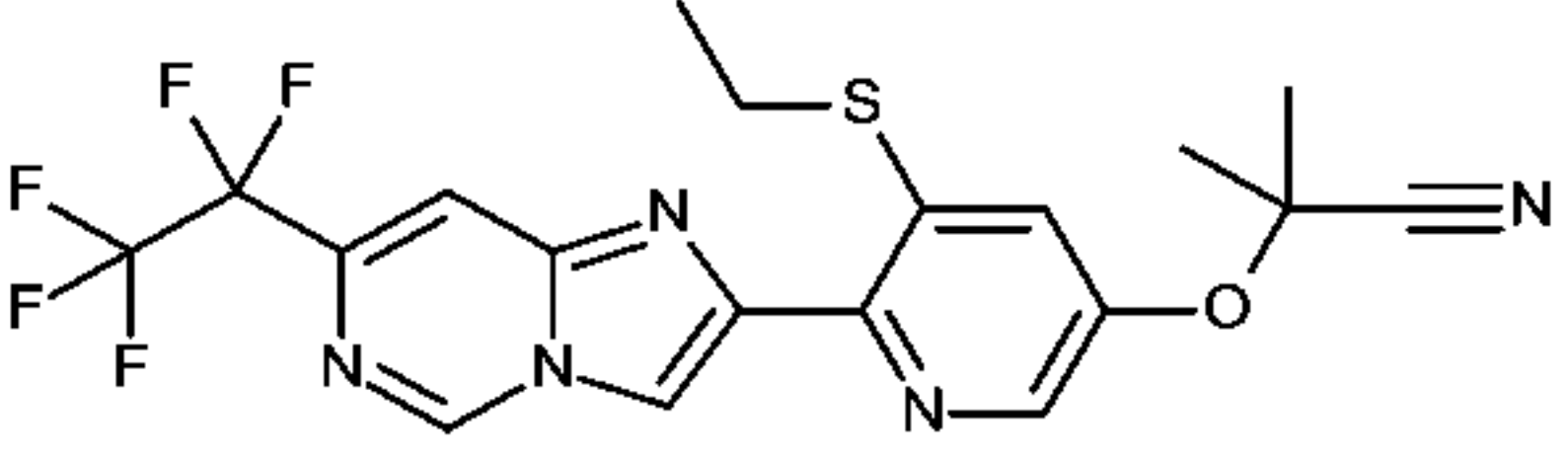
編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)	¹ H NMR
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法		
	基)咪唑并 [4,5-c]吡啶-2- 基]-3-吡啶基] 氧基]乙腈						
I12	2-[[5-乙基氫硫 基-2-甲基-6-[3- 甲基-6-(三氟甲 基)咪唑并 [4,5-c]吡啶-2- 基]-3-吡啶基] 氧基]-2-甲基- 丙腈		1.06	436	1		
I13	5-乙基氫硫基 -2-碘-6-[3-甲基 -6-(三氟甲基) 咪唑并[4,5-b] 吡啶-2-基]吡啶 -3-醇		1.06	480	1		

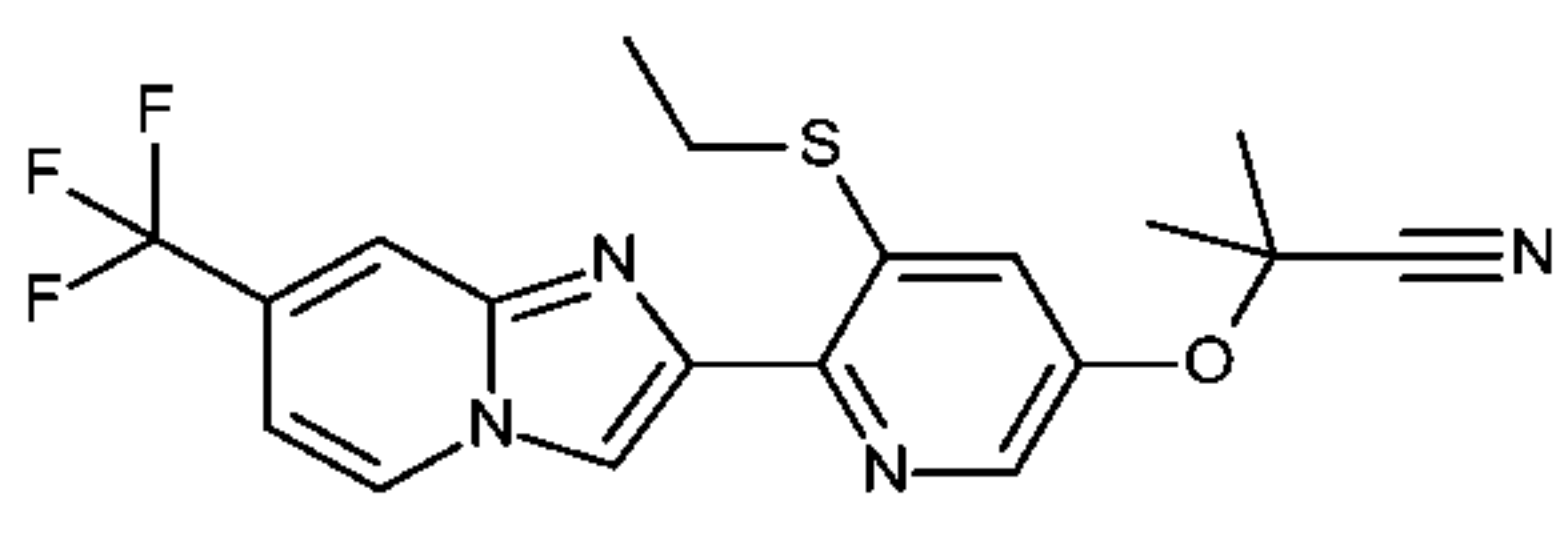
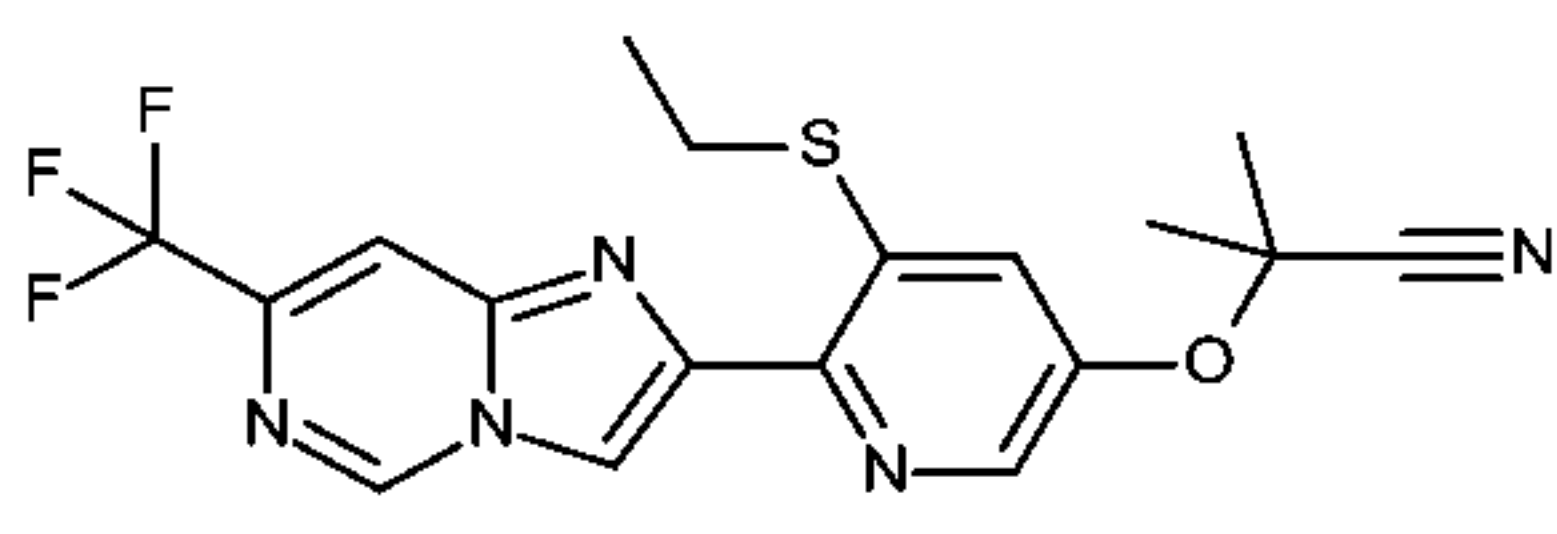
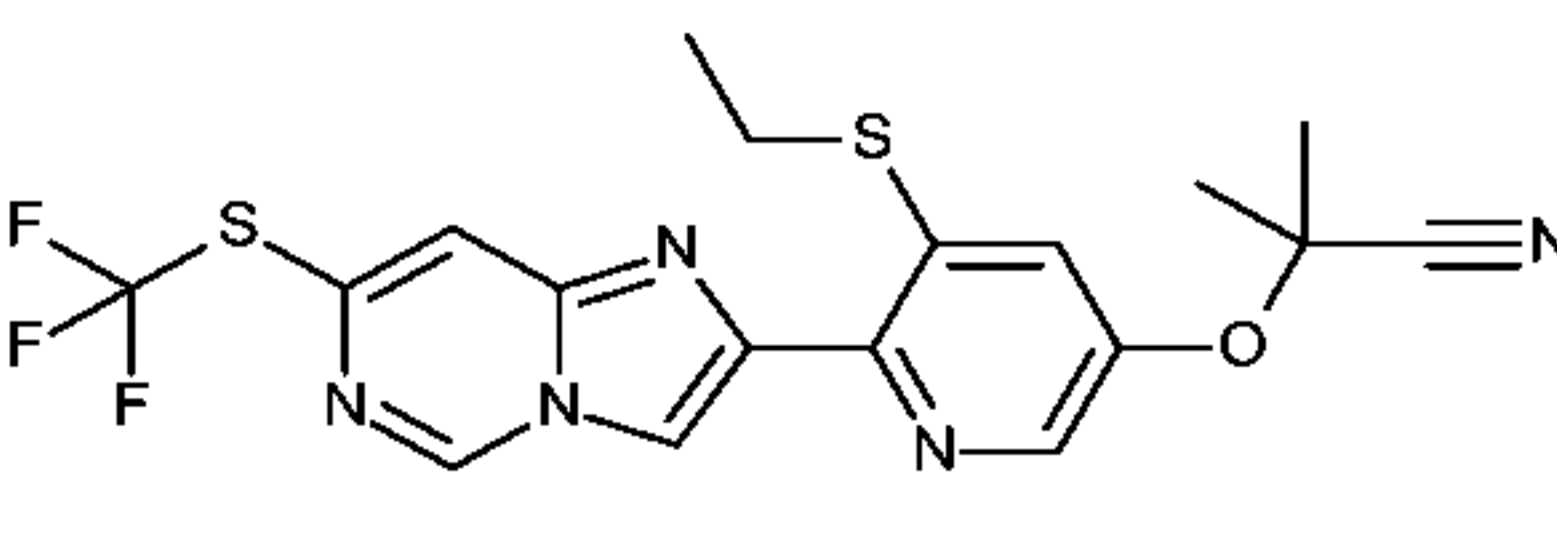
編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)	¹ H NMR
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法		
I14	5-乙基氫硫基 -2-甲基-6-[3-甲 基-6-(三氟甲 基)咪唑并 [4,5-b]吡啶-2- 基]吡啶-3-醇		0.96	369	1		
I15	2-[[5-乙基氫硫 基-2-甲基-6-[3- 甲基-6-(三氟甲 基)咪唑并 [4,5-b]吡啶-2- 基]-3-吡啶基] 氧基]乙腈		1.05	408	1		
I16	2-[[5-乙基氫硫 基-2-甲基-6-[3- 甲基-6-(三氟甲 基)咪唑并 [4,5-b]吡啶-2- 基]-3-吡啶基] 基]乙腈		1.16	436	1		

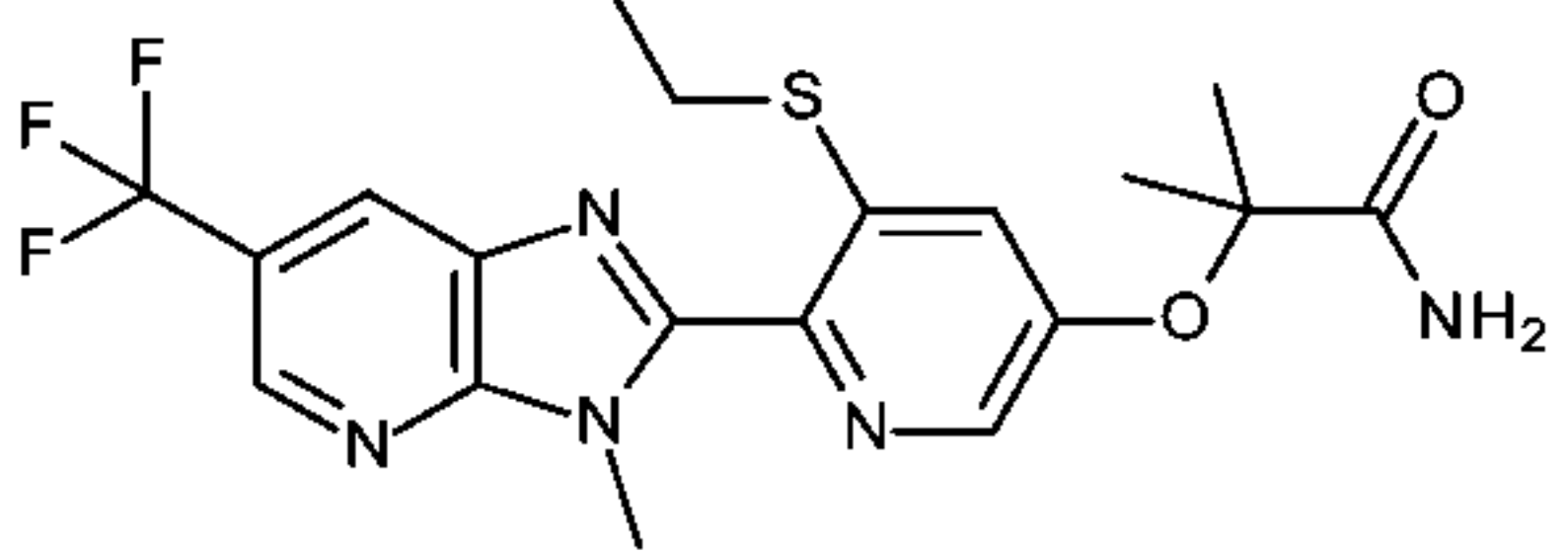
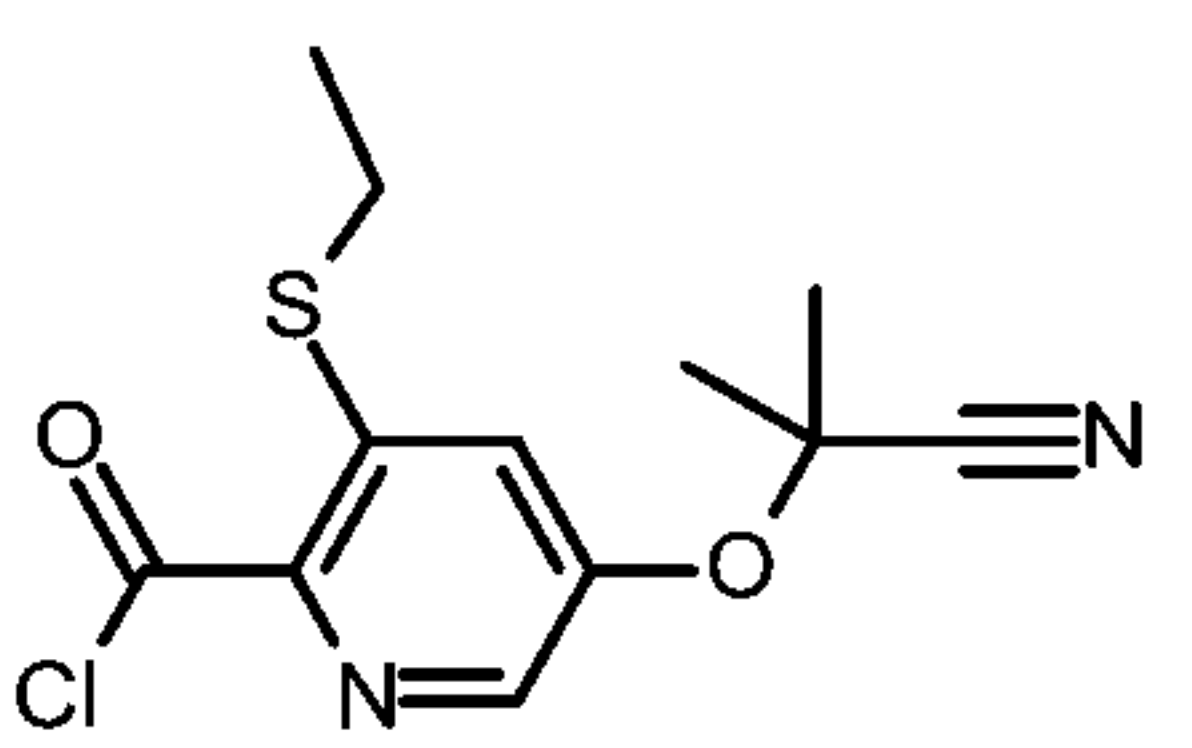
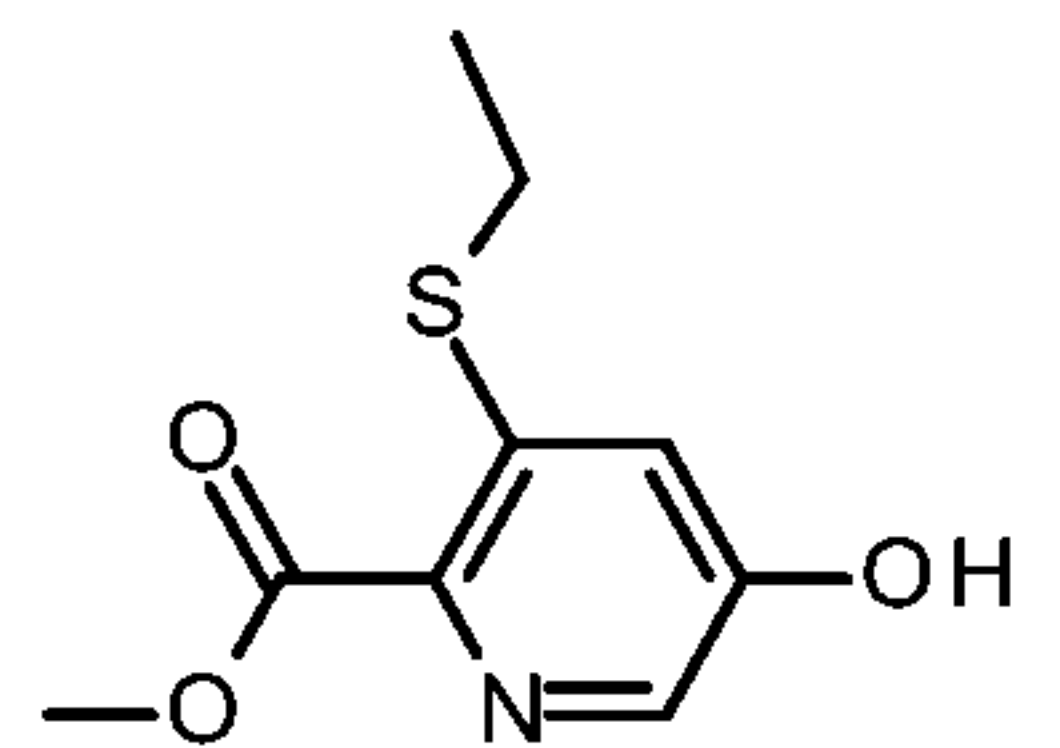
編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)	¹ H NMR
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法		
	氧基]-2-甲基- 丙腈						
I17	5-環丙基-2-(3- 乙基氫硫基-5- 羥基-2-吡啶 基)-3-甲基 -6-(三氟甲基) 咪唑并[4,5-c] 吡啶-4-酮		1.36	411	3		3)
I18	2-[[6-[5-環丙基 -3-甲基-4-側氧 基-6-(三氟甲 基)咪唑并 [4,5-c]吡啶-2- 基]-5-乙基氫硫 基-3-吡啶基]氧 基]乙腈		1.48	450	3		
I19	2-[[6-[5-環丙基 -3-甲基-4-側氧		1.54	478	3		

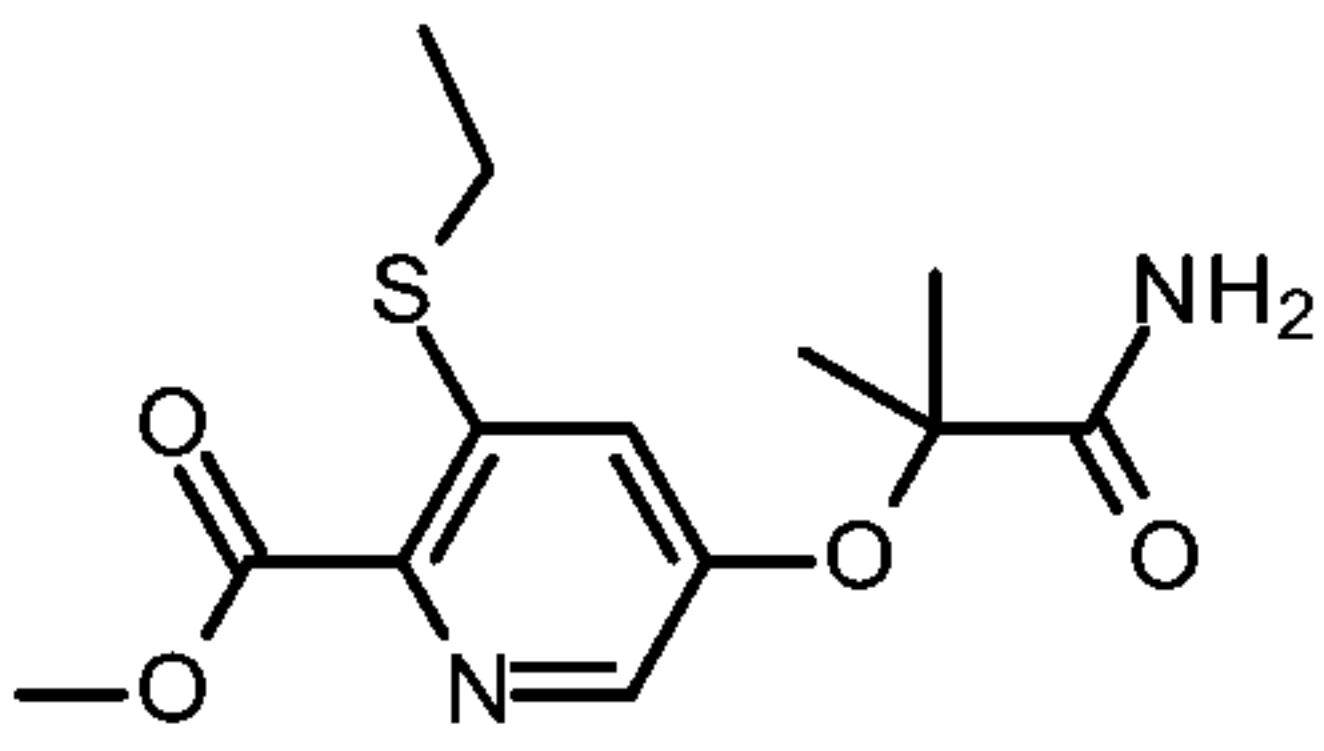
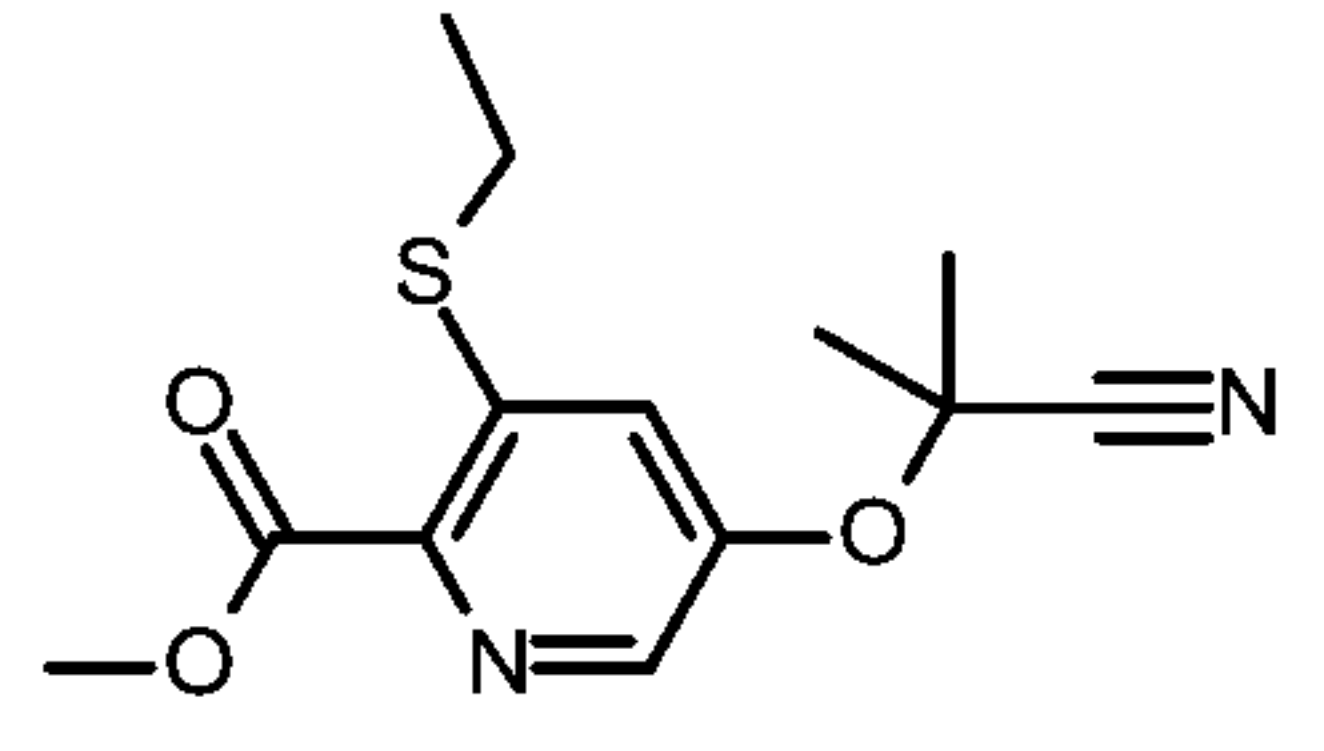
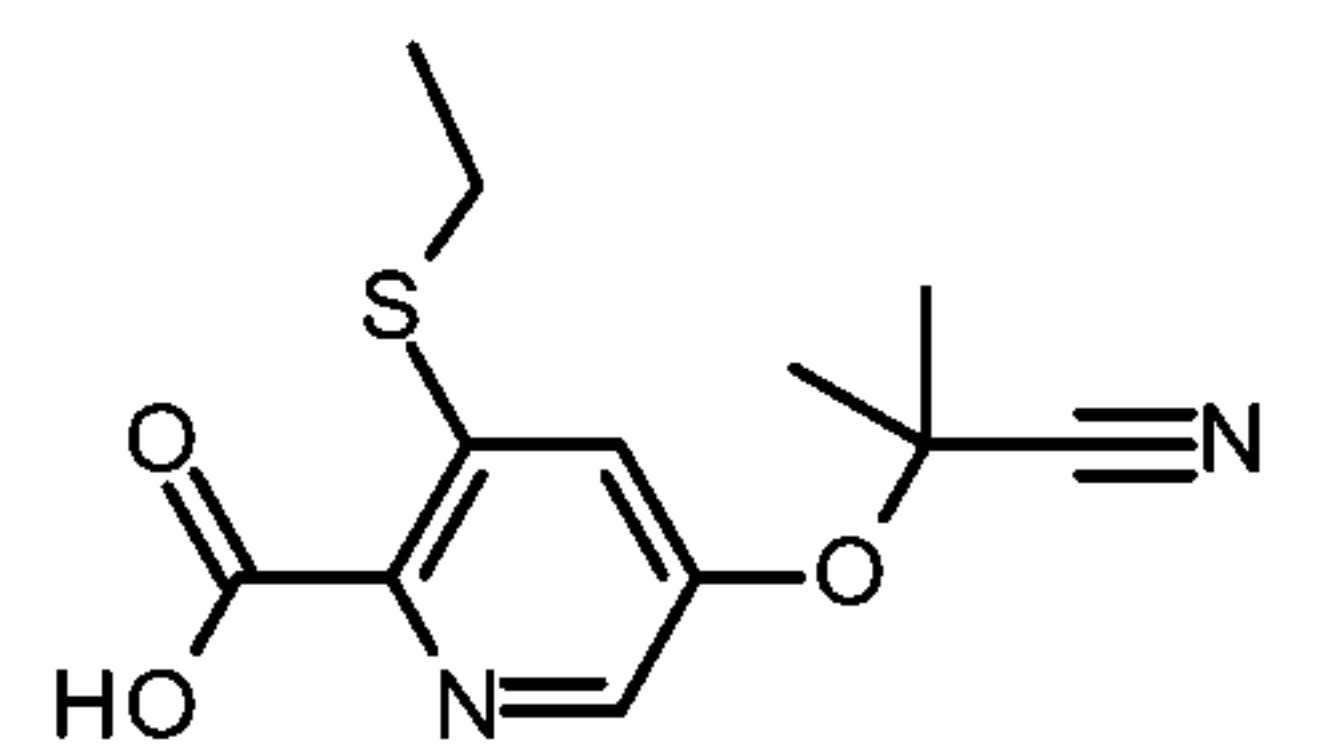
編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)	¹ H NMR
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法		
	基-6-(三氟甲基)咪唑并 [4,5-c]吡啶-2- 基]-5-乙基氫硫 基-3-吡啶基]氧 基]-2-甲基-丙 腈						
I20	5-乙基-2-(3-乙 基氫硫基-5-羥 基-2-吡啶 基)-3-甲基 -6-(三氟甲基) 咪唑并[4,5-c] 吡啶-4-酮		1.38	399	3		
I21	2-[[6-[5-乙基 -3-甲基-4-側氧 基-6-(三氟甲 基)咪唑并 [4,5-c]吡啶-2-		1.01	438	4		

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)	¹ H NMR
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法		
	基]-5-乙基氫硫 基-3-吡啶基]氧 基]乙腈						
I22	2-[[6-[5-乙基 -3-甲基-4-側氧 基-6-(三氟甲 基)咪唑并 [4,5-c]吡啶-2- 基]-5-乙基氫硫 基-3-吡啶基]氧 基]-2-甲基-丙 腈		1.10	466	4		
I23	1-(3-乙基氫硫 基-5-羥基-2-吡 啶基)乙酮						4)
I24	2-[(6-乙醯基-5- 乙基氫硫基-3- 吡啶基)氧 基]-2-甲基-丙						5)

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)	¹ H NMR
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法		
	醯胺						
I25	2-[(6-乙醯基-5-乙基氫硫基-3-吡啶基)氧基]-2-甲基-丙腈						6)
I26	2-[[6-(2-溴乙醯基)-5-乙基氫硫基-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈						7)
I27	2-[[5-乙基氫硫基-6-[7-(1,1,2,2,2-五氟乙基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈		1.10	458	1		

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)	¹ H NMR
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法		
I28	2-[[5-乙基氫硫 基-6-[7-(三氟 甲基)咪唑并 [1,2-a]吡啶-2- 基]-3-吡啶基] 氧基]-2-甲基- 丙腈		1.02	407	1		8)
I29	2-[[5-乙基氫硫 基-6-[7-(三氟 甲基)咪唑并 [1,2-c]嘓啶-2- 基]-3-吡啶基] 氧基]-2-甲基- 丙腈		1.03	408	1		9)
I30	2-[[5-乙基氫硫 基-6-[7-(三氟 甲基)氫硫基)咪 唑并[1,2-c]嘓 啶-2-基]-3-吡		1.06	440	1		10)

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)	¹ H NMR
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法		
	啖基]氧基]-2- 甲基-丙腈						
I31	2-[[5-乙基氫硫 基-6-[3-甲基 -6-(三氟甲基) 咪唑并[4,5-b] 吡啶-2-基]-3- 吡啶基]氧 基]-2-甲基-丙 醯胺		0.96	440	1	228-230	
I32	5-(1-氰基-1-甲 基-乙氧基)-3- 乙基氫硫基-吡 啶-2-碳醯氯	 ;對於 對應的N,N-二甲基甲醯 胺(C ₁₄ H ₁₉ N ₃ O ₂ S, 293.38) 的數據	0.83	294	1		
I33	3-乙基氫硫基 -5-羥基-吡啶 -2-甲酸甲酯		0.68	214	1		

編號	IUPAC名稱	結構	LCMS			Mp (°C)	¹ H NMR
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (測量的)	方法		
I34	5-(2-胺基-1,1-二甲基-2-側氧基-乙氧基)-3-乙基氫硫基-吡啶-2-甲酸甲酯		0.71	299	1		
I35	5-(1-氰基-1-甲基-乙氧基)-3-乙基氫硫基-吡啶-2-甲酸甲酯		0.90	281	1		
I36	5-(1-氰基-1-甲基-乙氧基)-3-乙基氫硫基-吡啶-2-甲酸		0.82	267	4		

¹) ¹H NMR (400 MHz, 二甲基亞砜-d₆) δ ppm 1.25 (t, *J*=7.34Hz, 3H) 2.99 (q, *J*=7.34Hz, 2H) 4.13 (s, 3H) 7.38 (d, *J*=2.20Hz, 1H) 8.17 (d, *J*=2.20Hz, 1H) 8.55 (s, 1H) 10.94 (s, 1H)

²) ¹H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.42 (t, *J*=7.34Hz, 3H) 1.88 (s, 6H) 3.03 (q, *J*=7.34Hz, 2H) 4.31 (s, 3H) 7.72 (d, *J*=2.57Hz, 1H) 8.26 (s, 1H) 8.39 (d, *J*=2.57Hz, 1H)

³) ¹H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.06 (br s, 2H) 1.18-1.37 (m, 5H) 2.75 (q, *J*=7.38Hz, 2H) 3.07-3.16 (m, 1H) 4.04 (s, 3H) 7.06 (d, *J*=2.45Hz, 1H) 7.28 (m, 1H)

7.98 (d, $J=2.45\text{Hz}$, 1H)

⁴) ¹H NMR (400 MHz, 二甲基亞砜-d₆) δ ppm 1.28 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 2.86 (q, $J=7.34\text{Hz}$, 2H) 3.33 (s, 3H) 7.15 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H) 7.98 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H) 10.94 (s br, 1H)

⁵) ¹H NMR (400 MHz, 二甲基亞砜-d₆) δ ppm 1.28 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.56 (s, 6H) 1.85 (s, 3H) 2.83 (q, $J=7.34\text{Hz}$, 2H) 7.15 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H) 7.33 (s, 1H) 7.45 (s, 1H) 8.04 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H)

⁶) ¹H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.44 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.83 (s, 6H) 2.71 (s, 3H) 2.93 (q, $J=7.34\text{Hz}$, 2H) 7.57 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H) 8.22 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H)

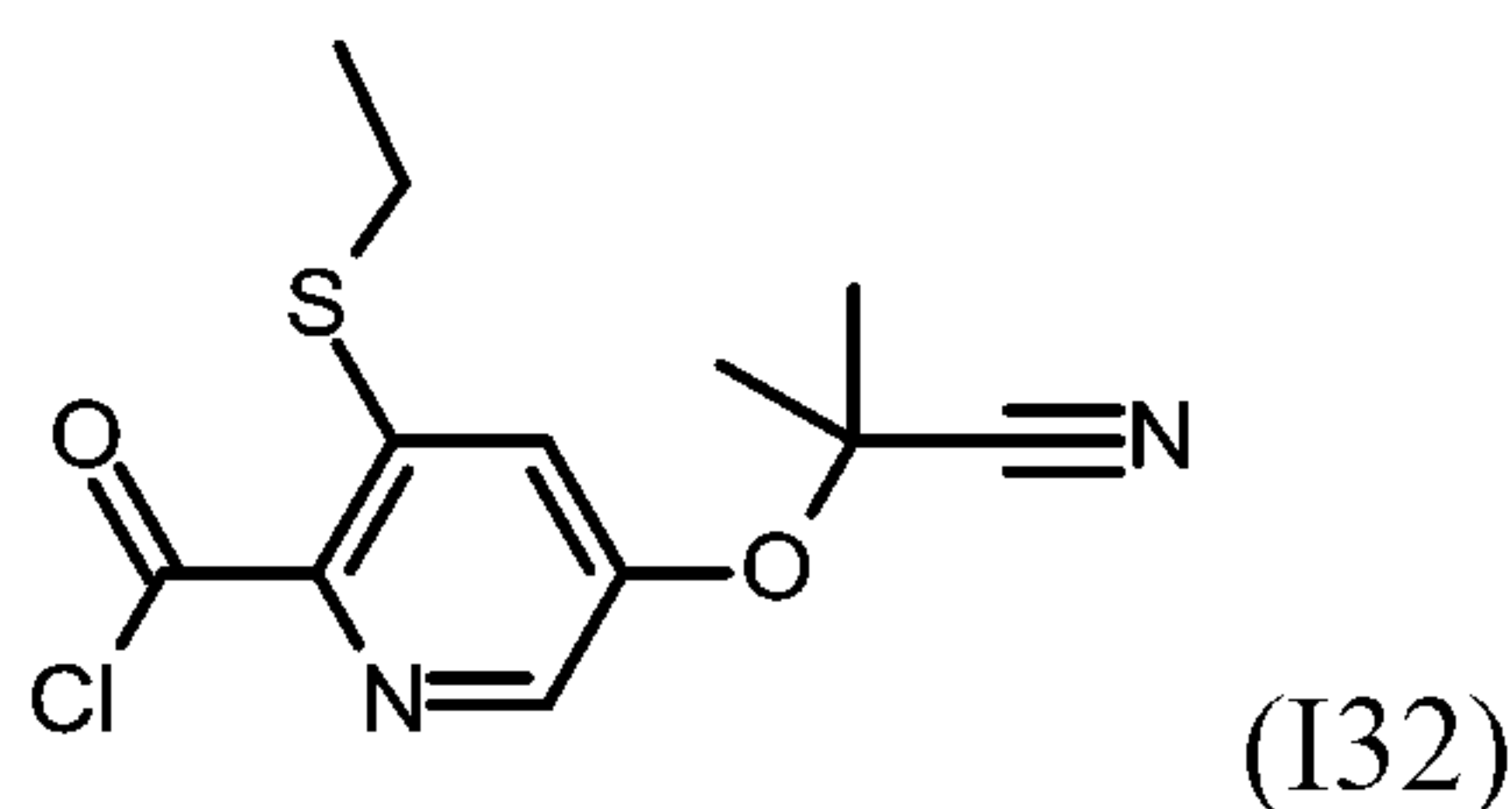
⁷) ¹H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.45 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.85 (s, 6H) 2.96 (q, $J=7.34\text{Hz}$, 2H) 4.82 (s, 2H) 7.59 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 8.21 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H)

⁸) ¹H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.44 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.81 (s, 6H) 3.04 (q, $J=7.34\text{Hz}$, 2H) 7.02 (dd, $J_1=7.34$; $J_2=1.65\text{Hz}$, 1H) 7.65 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 8.06 (s, 1H) 8.29 (d, $J=7.34\text{Hz}$, 1H) 8.32 (d, $J=2.57\text{Hz}$, 1H) 8.37 (d, $J=1.65\text{Hz}$, 1H)

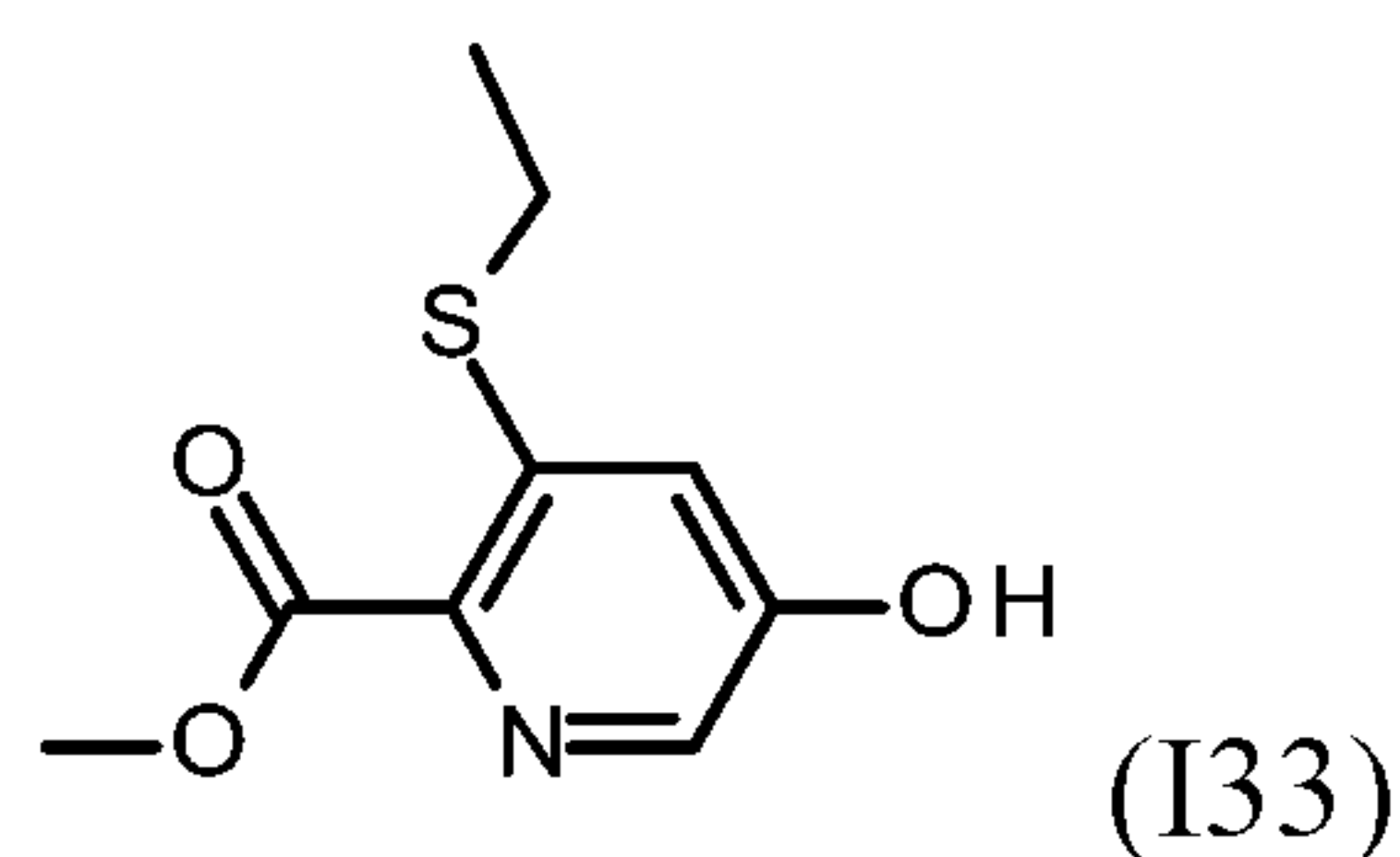
⁹) ¹H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.44 (t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.81 (s, 6H) 3.04 (q, $J=7.34\text{Hz}$, 2H) 7.67 (s, 1H) 8.05 (s, 1H) 8.34 (s, 1H) 8.45 (s, 1H) 9.18 (s, 1H)

¹⁰) ¹H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm 1.44 (m, 3H) 1.82 (s, 6H) 3.05 (m, 2H) 7.66 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H) 8.02 (s, 1H) 8.34 (d, $J=2.20\text{Hz}$, 1H) 8.39 (s, 1H) 9.10 (s, 1H)。

實施例I32：5-(1-氰基-1-甲基-乙氧基)-3-乙基氫硫基-吡啶-2-碳醯氯（化合物I32）的製備

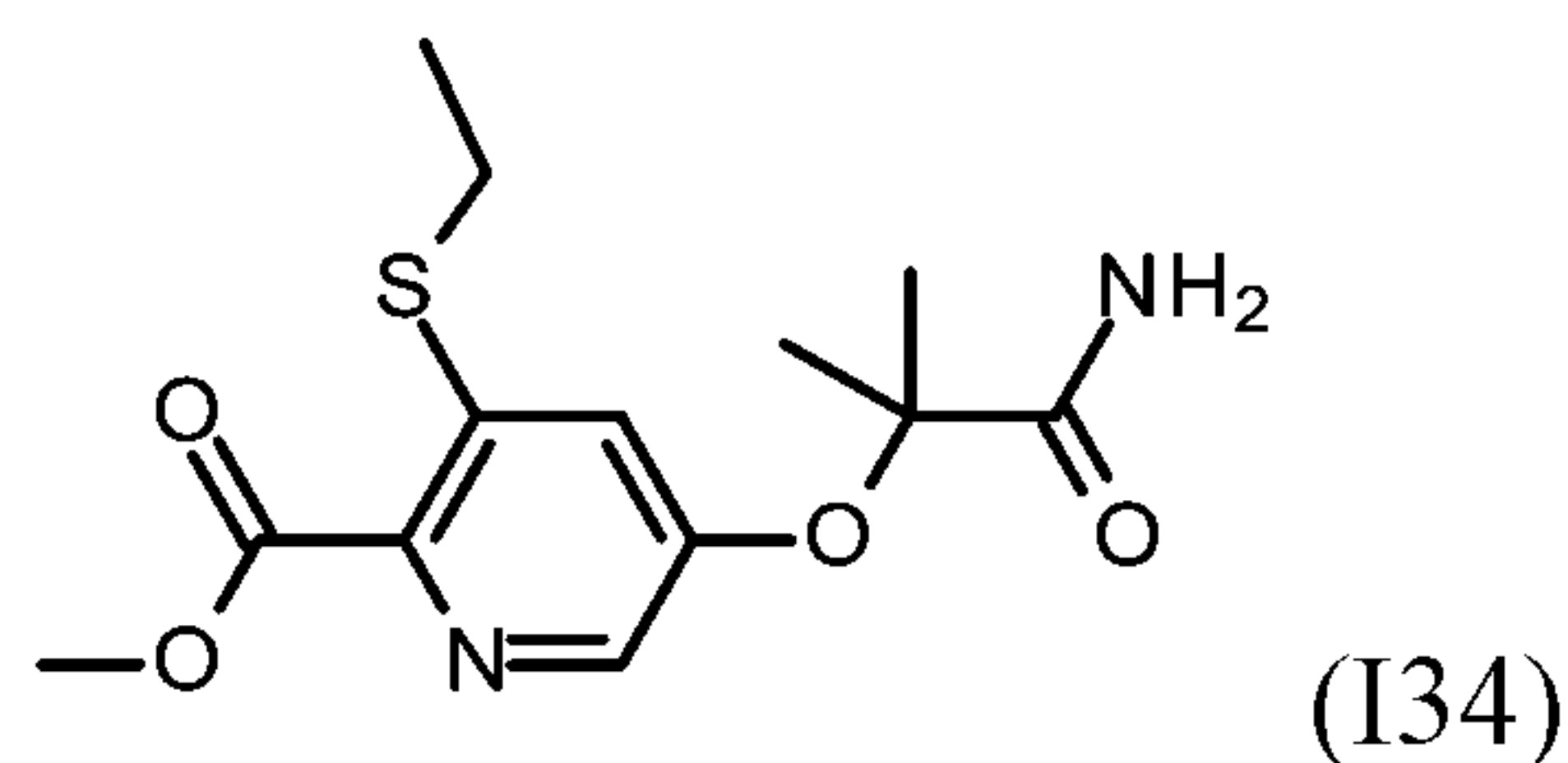


步驟1：3-乙基氫硫基-5-羥基-吡啶-2-甲酸甲酯（化合物I33）的製備



【0342】 向5-溴-3-乙基氫硫基-吡啶-2-甲酸甲酯（如WO 2016/026848中所描述製備）（10.0 g，36.21 mmol）在乙腈（72 ml）中的溶液中添加碳酸鉀（25.96 g，79.67 mmol）和(E)-苯甲醛肟（5.7 g，47.08 mmol），並且將懸浮液加熱至80°C過夜。將溶劑在真空中蒸發，並且將殘餘物用乙酸乙酯和水溶解。將分離的水層用1 M鹽酸水溶液酸化，並且用乙酸乙酯（3x）萃取並且用二氯甲烷萃取一次。將合併的有機相經硫酸鈉乾燥，過濾並且濃縮。將殘餘物藉由在矽膠上快速層析法（在二氯甲烷中的梯度0-10%甲醇）純化，以得到3-乙基氫硫基-5-羥基-吡啶-2-甲酸甲酯（化合物I33）。LCMS（方法1）： m/z 214 $[M+H]^+$ ；保留時間：0.68 min。

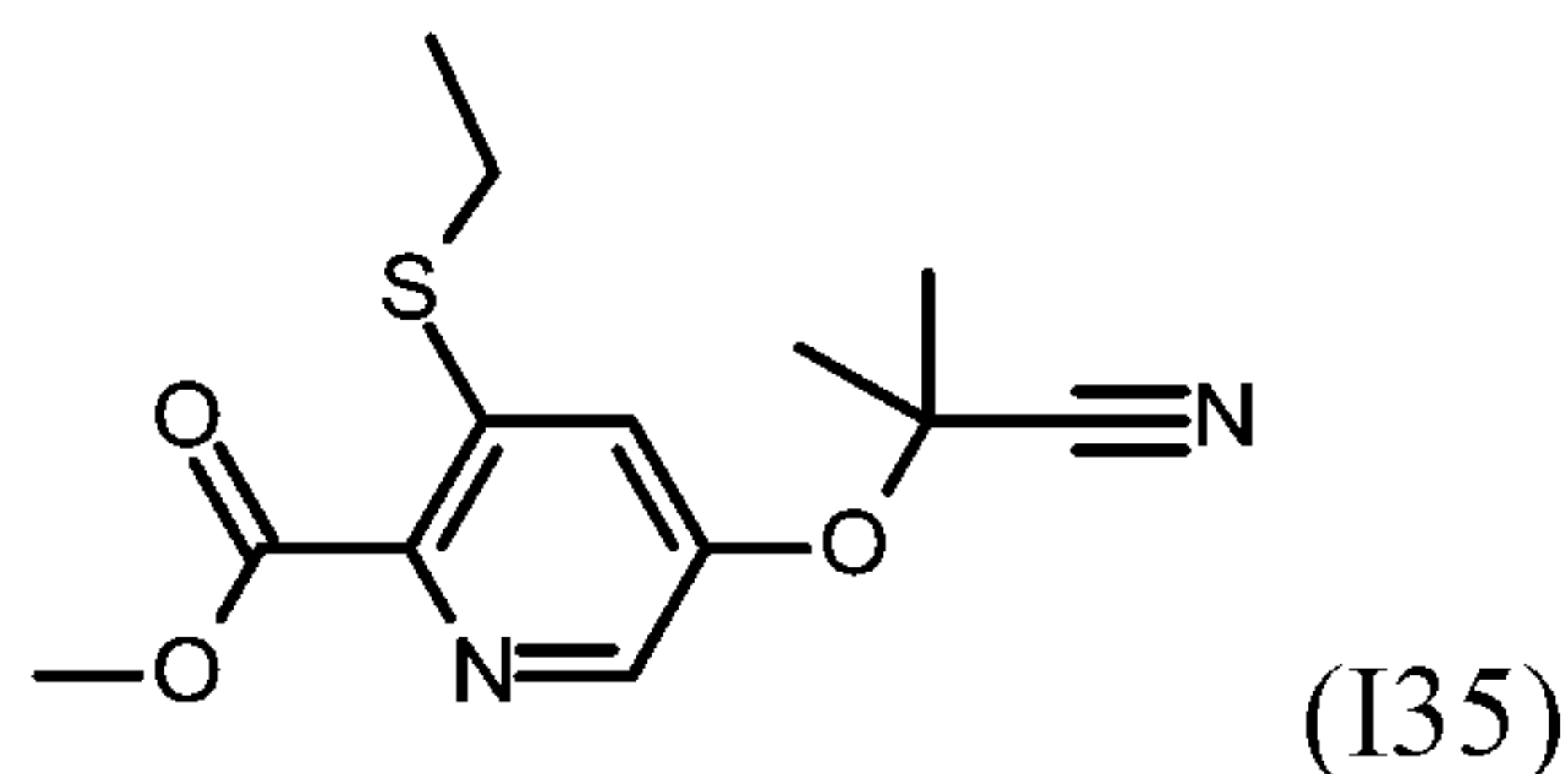
步驟2：5-(2-胺基-1,1-二甲基-2-側氧基-乙氧基)-3-乙基氫硫基-吡啶-2-甲酸甲酯（化合物I34）的製備



【0343】 在5分鐘後，向3-乙基氫硫基-5-羥基-吡啶-2-甲酸甲酯（化合物I33）（2.5 g，11.72 mmol）在乙腈（59 ml）中的溶液中添加碳酸鉀（5.7 g，17.49 mmol）和2-溴-2-甲基-丙醯胺（3.1 g，18.67 mmol）。將反應混合物在室溫下攪拌過夜，傾倒入水和乙酸乙酯中。將分離的水層用乙酸乙酯（3x）萃取，將合併的有機層經硫酸鈉乾燥，過濾並且蒸發，以得到粗的5-(2-胺基-1,1-二甲基-2-側氧基-乙氧基)-3-乙基氫硫基-吡啶-2-甲酸甲酯（化合物I34）。此材料無需進一步純化即可用於下一步驟。LCMS（方法1）： m/z 299 $[M+H]^+$ ；保留時間：0.71

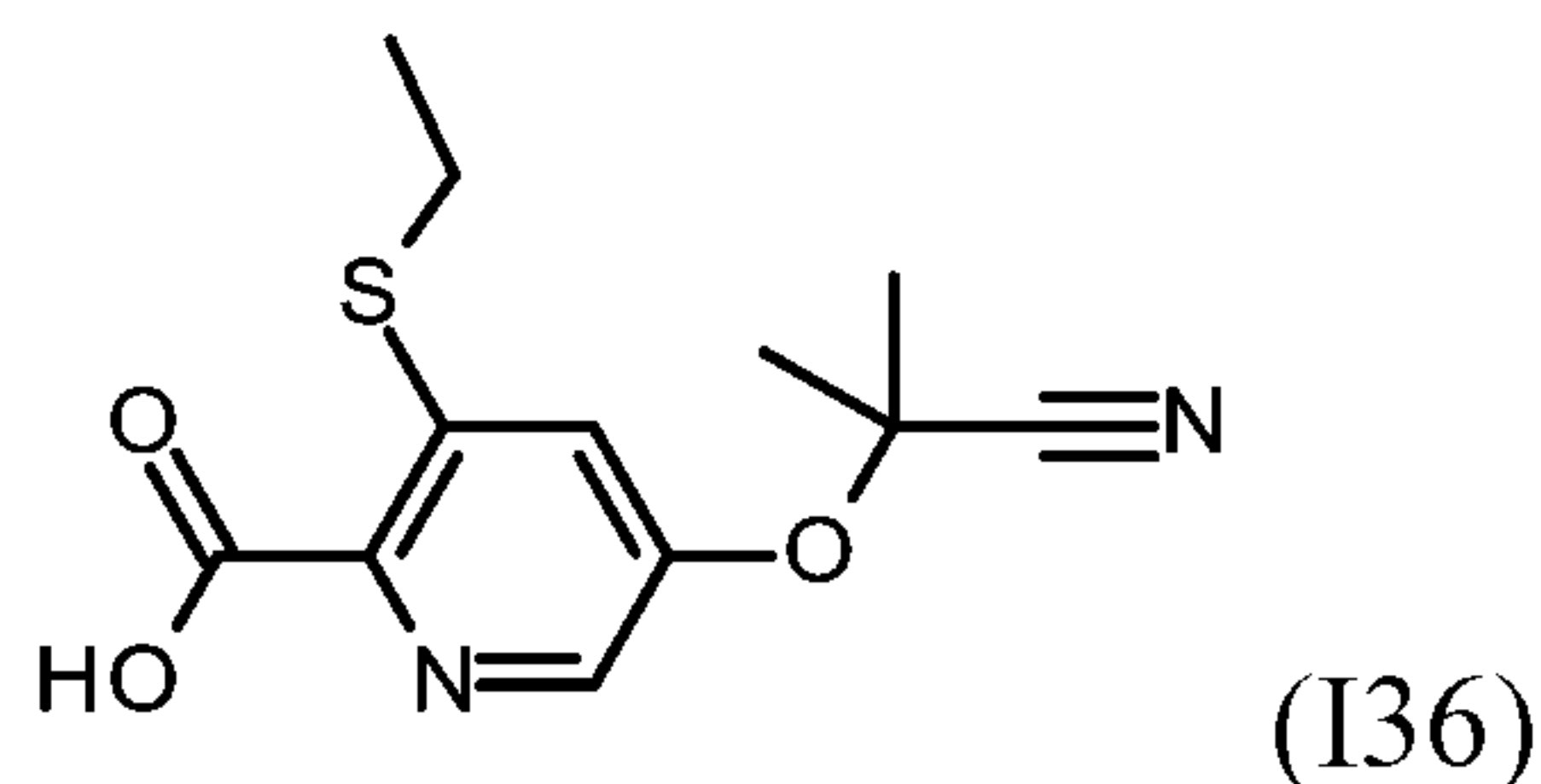
min。

步驟3：5-(1-氰基-1-甲基-乙氧基)-3-乙基氫硫基-吡啶-2-甲酸甲酯（化合物I35）的製備



【0344】 在0°C下，向粗5-(2-胺基-1,1-二甲基-2-側氧基-乙氧基)-3-乙基氫硫基-吡啶-2-甲酸甲酯（上面製備的化合物I34）（4.18 g，14.0 mmol）和三乙胺（5.73 g，7.89 ml，56.0 mmol）在二氯甲烷（140 ml）中的混合物中逐滴添加三氟乙酸酐（8.92 g，5.90 ml，42.0 mmol）。將所得懸浮液在室溫下攪拌兩小時。用甲醇、然後用碳酸氫鈉水溶液小心地淬滅反應混合物。將水層用二氯甲烷萃取兩次，將合併的有機層用硫酸鈉乾燥，過濾並且蒸發。將殘餘物藉由combiflash（在環己烷中的0-45%梯度乙酸乙酯）純化，以得到5-(1-氰基-1-甲基-乙氧基)-3-乙基氫硫基-吡啶-2-甲酸甲酯（化合物I35）。LCMS（方法1）：m/z 281 [M+H]⁺；保留時間：0.90 min。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.43 (t, J=7.40 Hz, 3H), 1.80 (s, 6H), 2.95 (q, J=7.40 Hz, 2H), 3.99 (s, 3H), 7.58 (d, J=2.32 Hz, 1H), 8.22 (d, J=2.32 Hz, 1H)。

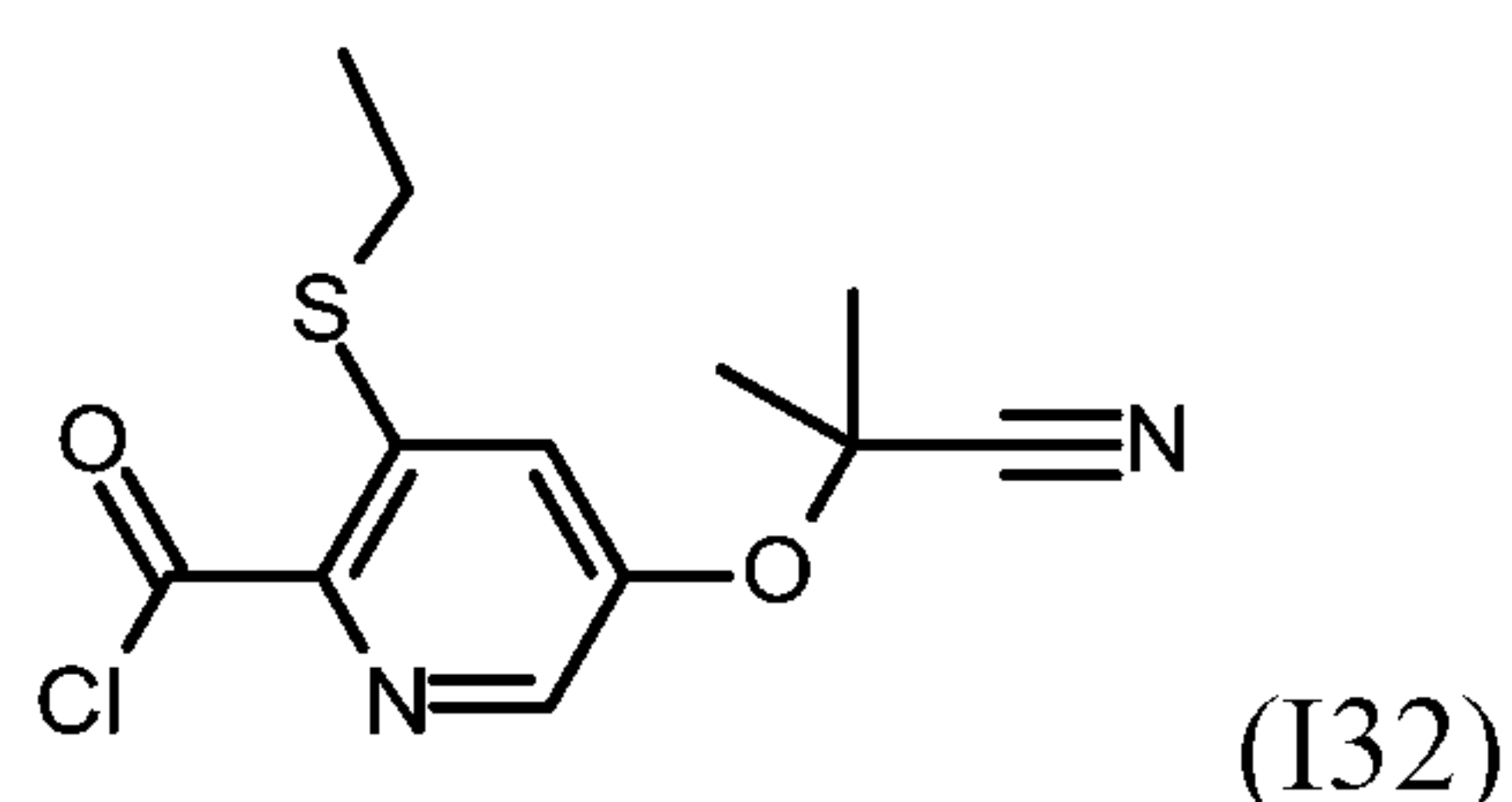
步驟4：5-(1-氰基-1-甲基-乙氧基)-3-乙基氫硫基-吡啶-2-甲酸（化合物I36）的製備



【0345】 向5-(1-氰基-1-甲基-乙氧基)-3-乙基氫硫基-吡啶-2-甲酸甲酯（化合物I35）（6.0 g，21.41 mmol）在四氫呋喃（60 ml）中的溶液中添加氫氧化鋰

水合物 (1.8 g, 42.81 mmol) 和水 (10 ml)。將反應混合物在室溫下攪拌直至完全 (TLC監測)，然後在減壓下濃縮。將殘餘物用水 (100 ml) 稀釋，用 2 N 鹽酸水溶液酸化，並且將水相用乙酸乙酯 (3x 100 ml) 萃取。將合併的有機層經硫酸鈉乾燥，過濾並且在真空中濃縮。將粗產物用正戊烷 (50 ml) 洗滌兩次，過濾並且蒸發至乾，以給出呈固體的 5-(1-氰基-1-甲基-乙氧基)-3-乙基氫硫基-吡啶-2-甲酸 (化合物 I36)。LCMS (方法 4) : m/z 267 $[M+H]^+$ 和 m/z 265 $[M-H]^-$; 保留時間 : 0.82 min。 1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 1.27 (t, $J=7.21$ Hz, 3H), 1.78 (s, 6H), 2.97 (q, $J=7.21$ Hz, 2H), 7.58 (d, $J=2.32$ Hz, 1H), 8.24 (d, $J=2.32$ Hz, 1H)。

步驟 5 : 5-(1-氰基-1-甲基-乙氧基)-3-乙基氫硫基-吡啶-2-碳醯氯 (化合物 I32) 的製備



【0346】 在 0°C - 5°C 下，向 5-(1-氰基-1-甲基-乙氧基)-3-乙基氫硫基-吡啶-2-甲酸 (化合物 I36) (771 mg, 2.90 mmol) 和 N,N-二甲基甲醯胺 (一滴) 在四氫呋喃 (19 ml) 中的溶液中添加草醯氯 (0.328 ml, 3.76 mmol) 並且將混合物在室溫下攪拌 2 小時。將溶液在減壓下濃縮，用四氫呋喃稀釋兩次並且蒸發至乾。用與 5-(1-氰基-1-甲基-乙氧基)-3-乙基氫硫基-N,N-二甲基吡啶-2-甲醯胺 ($\text{C}_{14}\text{H}_{19}\text{N}_3\text{O}_2\text{S}$, 293.38) 一致的二甲基胺淬滅的等分試樣的 LCMS 數據 : LCMS (方法 1) : m/z 294 $[M+H]^+$; 保留時間 : 0.83 min。

【0347】 式 I 的化合物與活性成分的以下混合物係較佳的 (縮寫「TX」意指「選自由本發明的表 A-1 至 A-17 和表 P 中描述的化合物組成的群組的化合物」):

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

殺蟎劑，該殺蟎劑選自由以下物質組成之群組：1,1-雙(4-氯苯基)-2-乙氧基乙醇 (IUPAC名稱) (910) + TX、2,4-二氯苯基苯磺酸酯 (IUPAC/化學文摘名) (1059) + TX、2-氟-N-甲基-N-1-萘乙醯胺 (IUPAC名稱) (1295) + TX、4-氯苯基苯基砒 (IUPAC名稱) (981) + TX、阿巴美丁 (1) + TX、滅蟎醌 (acequinocyl) (3) + TX、乙醯蟲脞 (acetoprole) [CCN] + TX、氟丙菊酯 (acrinathrin) (9) + TX、涕滅威 (aldicarb) (16) + TX、涕滅砒威 (aldoxycarb) (863) + TX、 α -氰菊酯 (alpha-cypermethrin) (202) + TX、賽硫磷 (amidithion) (870) + TX、磺胺蟎酯 (amidoflumet) [CCN] + TX、胺基硫代鹽 (amidothioate) (872) + TX、胺吸磷 (amiton) (875) + TX、胺吸磷草酸氫鹽 (amiton hydrogen oxalate) (875) + TX、雙甲脒 (amitraz) (24) + TX、殺蟎特 (aramite) (881) + TX、三氧化二砷 (882) + TX、AVI 382 (化合物代碼) + TX、AZ 60541 (化合物代碼) + TX、益棉磷 (44) + TX、保棉磷 (azinphos-methyl) (45) + TX、偶氮苯 (IUPAC名稱) (888) + TX、三唑錫 (azacyclotin) (46) + TX、偶氮磷 (azothoate) (889) + TX、苯菌靈 (62) + TX、苯諾沙磷 (benoxafos) (別名) [CCN] + TX、苯蟎特 (benzoximate) (71) + TX、苯甲酸苄酯 (IUPAC名稱) [CCN] + TX、聯苯肼酯 (bifenazate) (74) + TX、氟氯菊酯 (bifenthrin) (76) + TX、樂殺蟎 (binapacryl) (907) + TX、溴滅菊酯 (brofenvalerate) (別名) + TX、溴烯殺 (bromocyclene) (918) + TX、溴硫磷 (bromophos) (920) + TX、乙基溴硫磷 (921) + TX、溴蟎酯 (bromopropylate) (94) + TX、噻吡啶酮 (buprofezin) (99) + TX、丁酮威 (butocarboxim) (103) + TX、丁酮砒威 (butoxycarboxim) (104) + TX、丁基噻蟎酮 (butylpyridaben) (別名) + TX、多硫化鈣 (calcium polysulfide) (IUPAC名稱) (111) + TX、毒殺芬 (camphochlor) (941) + TX、氯滅殺威 (carbanolate) (943) + TX、甲萘威 (115) + TX、克百威 (carbofuran) (118) + TX、卡波硫磷 (carbophenothion) (947) + TX、CGA 50'439 (發展

代碼) (125) + TX、滅蟎猛 (chinomethionat) (126) + TX、殺蟎醚 (chlorbenside) (959) + TX、殺蟲脒 (chlordimeform) (964) + TX、殺蟲脒鹽酸鹽 (964) + TX、溴蟲腈 (chlorfenapyr) (130) + TX、敵蟎 (chlorfenethol) (968) + TX、殺蟎酯 (chlorfenson) (970) + TX、敵蟎特 (chlorfensulfide) (971) + TX、氯芬磷 (131) + TX、乙酯殺蟎醇 (chlorobenzilate) (975) + TX、伊托明 (chloromebuform) (977) + TX、滅蟲脲 (chloromethiuron) (978) + TX、丙酯殺蟎醇 (chloropropylate) (983) + TX、毒死蜱 (chlorpyrifos) (145) + TX、甲基毒死蜱 (146) + TX、蟲蟎磷 (chlorthiophos) (994) + TX、瓜菊酯 (cinerin) I (696) + TX、瓜菊酯11 (696) + TX、瓜葉菊素 (cinerins) (696) + TX、四蟎吡 (clofentezine) (158) + TX、氯氰碘柳胺[CCN] (別名) + TX、庫馬磷 (174) + TX、克羅米通 (別名) [CCN] + TX、巴毒磷 (crotoxyphos) (1010) + TX、硫雜靈 (1013) + TX、果蟲磷 (cyanthoate) (1020) + TX、丁氟蟎酯 (CAS 登記號：400882-07-7) + TX、三氯氟氰菊酯 (cyhalothrin) (196) + TX、三環錫 (199) + TX、氯氰菊酯 (201) + TX、DCPM (1032) + TX、DDT (219) + TX、田樂磷 (demephion) (1037) + TX、田樂磷 (demephion) -O (1037) + TX、田樂磷-S (1037) + TX、內吸磷 (demeton) (1038) + TX、甲基內吸磷 (224) + TX、內吸磷-O (1038) + TX、甲基內吸磷-O (224) + TX、內吸磷-S (1038) + TX、甲基內吸磷-S (224) + TX、內吸磷-S-甲基磺隆 (demeton-S-methylsulfon) (1039) + TX、殺蟎隆 (diafenthiuron) (226) + TX、dimpropyridaz + TX、氯亞胺硫磷 (dialifos) (1042) + TX、二吡磷 (diazinon) (227) + TX、苯氟磺胺 (230) + TX、敵敵畏 (236) + TX、甲氟磷 (dicliphos) (別名) + TX、開樂散 (242) + TX、百治磷 (243) + TX、遍地克 (1071) + TX、甲氟磷 (dimefox) (1081) + TX、樂果 (dimethoate) (262) + TX、二甲殺蟎黴素 (dinacti) (別名) (653) + TX、消蟎酚 (dinex) (1089) + TX、消蟎酚 (dinex-diclexine)

(1089) + TX、消蟊通 (dinobuton) (269) + TX、敵蟊普 (dinocap) (270) + TX、敵蟊普-4 [CCN] + TX、敵蟊普-6 [CCN] + TX、二硝酯 (1090) + TX、硝戊酯 (dinopenton) (1092) + TX、硝辛酯 (dinosulfon) (1097) + TX、硝丁酯 (dinoterbon) (1098) + TX、敵惡磷 (1102) + TX、二苯砒 (IUPAC名稱) (1103) + TX、雙硫侖 [CCN] + TX、乙拌磷 (278) + TX、DNOC (282) + TX、苯氧炔蟊 (dofenapyn) (1113) + TX、朵拉克汀 (別名) [CCN] + TX、硫丹 (294) + TX、因毒磷 (endothion) (1121) + TX、EPN (297) + TX、依立諾克丁 (別名) [CCN] + TX、乙硫磷 (309) + TX、益硫磷 (ethoate-methyl) (1134) + TX、乙蟊唑 (etoxazole) (320) + TX、乙噁硫磷 (etrimfos) (1142) + TX、抗蟊唑 (fenazaflor) (1147) + TX、喹蟊醚 (328) + TX、苯丁錫 (fenbutatin oxide) (330) + TX、苯硫威 (fenothiocarb) (337) + TX、甲氰菊酯 (342) + TX、吡蟊胺 (fenpyrad) (別名) + TX、唑蟊酯 (fenpyroximate) (345) + TX、芬蟊酯 (fenson) (1157) + TX、氟硝二苯胺 (fentrifanil) (1161) + TX、氰戊菊酯 (349) + TX、氟蟲腓 (354) + TX、噁蟊酯 (fluacrypyrim) (360) + TX、氟佐隆 (1166) + TX、氟蟊噻 (flubenzimine) (1167) + TX、氟蟊脲 (366) + TX、氟氰戊菊酯 (flucythrinate) (367) + TX、聯氟蟊 (fluenetil) (1169) + TX、氟蟲脲 (370) + TX、氟氯苯菊酯 (flumethrin) (372) + TX、氟殺蟊 (fluorbenside) (1174) + TX、氟胺氰菊酯 (fluvalinate) (1184) + TX、FMC 1137 (發展代碼) (1185) + TX、抗蟊脛 (405) + TX、抗蟊脛鹽酸鹽 (405) + TX、安硫磷 (formothion) (1192) + TX、胺甲威 (formparanate) (1193) + TX、 γ -HCH (430) + TX、果綠啖 (glyodin) (1205) + TX、苜蟊醚 (halfenprox) (424) + TX、庚烯醚 (heptenophos) (432) + TX、十六碳烷基環丙烷羧酸酯 (IUPAC/化學文摘名) (1216) + TX、噁蟊酮 (441) + TX、碘甲烷 (IUPAC名稱) (542) + TX、水胺硫磷 (isocarbophos) (別名) (473) + TX、O-(甲氧基胺基硫代磷醯基)水楊

酸異丙酯 (IUPAC名稱) (473) + TX、艾弗麥克素 (別名) [CCN] + TX、茉莉
 菊酯 (jasmolin) I (696) + TX、茉莉菊酯II (696) + TX、碘硫磷 (jodfenphos)
 (1248) + TX、靈丹 (430) + TX、虱蟎脲 (lufenuron) (490) + TX、馬拉松
 (492) + TX、苡丙二腈 (malonoben) (1254) + TX、滅加松 (mecarbam) (502)
 + TX、地胺磷 (mephosfolan) (1261) + TX、甲硫芬 (mesulfen) (別名) [CCN]
 + TX、蟲蟎畏 (methacrifos) (1266) + TX、甲胺磷 (527) + TX、殺撲磷 (methidathion)
 (529) + TX、滅賜克 (530) + TX、滅多蟲 (methomyl) (531) + TX、溴甲
 烷 (537) + TX、速滅威 (metolcarb) (550) + TX、美文松 (556) + TX、自
 克威 (mexacarbate) (1290) + TX、米爾蟎素 (milbemectin) (557) + TX、殺
 蟎菌素肟 (milbemycin oxime) (別名) [CCN] + TX、丙胺氟磷 (mipafox) (1293)
 + TX、久效磷 (monocrotophos) (561) + TX、茂硫磷 (morphothion) (1300)
 + TX、莫昔克丁 (moxidectin) (別名) [CCN] + TX、二溴磷 (naled) (567)
 + TX、NC-184 (化合物代碼) + TX、NC-512 (化合物代碼) + TX、氟蚊靈
 (nifluridide) (1309) + TX、尼柯黴素 (別名) [CCN] + TX、戊氰威 (nitrilacarb)
 (1313) + TX、戊氰威 (nitrilacarb) 1:1氯化鋅錯合物 (1313) + TX、NNI-0101
 (化合物代碼) + TX、NNI-0250 (化合物代碼) + TX、氧樂果 (omethoate) (594)
 + TX、殺線威 (oxamyl) (602) + TX、亞異砒磷 (oxydeprofos) (1324) + TX、
 砒拌磷 (oxydisulfoton) (1325) + TX、pp'-DDT (219) + TX、對硫磷 (615)
 + TX、氯菊酯 (626) + TX、石油 (別名) (628) + TX、芬硫磷 (1330) + TX、
 稻豐散 (631) + TX、甲拌磷 (636) + TX、伏殺硫磷 (637) + TX、硫環磷 (phosfolan)
 (1338) + TX、亞胺硫磷 (638) + TX、磷胺 (639) + TX、辛硫磷 (642) + TX、
 甲基嘧啶磷 (652) + TX、氯化松節油 (polychloroterpenes) (慣用名) (1347)
 + TX、殺蟎黴素 (polynactins) (別名) (653) + TX、丙氯諾 (1350) + TX、
 丙溴磷 (662) + TX、蟬虱威 (promacyl) (1354) + TX、克蟎特 (671) + TX、

胺丙畏(propetamphos)(673)+TX、殘殺威(678)+TX、乙噻唑磷(prothidathion)
 (1360)+TX、發硫磷(prothoate)(1362)+TX、除蟲菊酯I(696)+TX、
 除蟲菊酯II(696)+TX、除蟲菊素(pyrethrins)(696)+TX、噠蟎靈(699)
 +TX、嗒吡硫磷(pyridaphenthion)(701)+TX、嘧蟎醚(pyrimidifen)(706)
 +TX、嘧硫磷(1370)+TX、喹硫磷(quinalphos)(711)+TX、喹硫磷(quintiofos)
 (1381)+TX、R-1492(發展代碼)(1382)+TX、RA-17(發展代碼)(1383)
 +TX、魚藤酮(722)+TX、八甲磷(schradan)(1389)+TX、硫線磷(sebufos)
 (別名)+TX、塞拉菌素(selamectin)(別名)[CCN]+TX、SI-0009(化合物
 代碼)+TX、蘇硫磷(sophamide)(1402)+TX、季酮蟎酯(738)+TX、螺
 甲蟎酯(739)+TX、SSI-121(發展代碼)(1404)+TX、舒非侖(別名)[CCN]
 +TX、氟蟲胺(sulfluramid)(750)+TX、治螟磷(sulfotep)(753)+TX、
 硫黃(754)+TX、SZI-121(發展代碼)(757)+TX、氟胺氰菊酯(398)+TX、
 吡蟎胺(763)+TX、TEPP(1417)+TX、三級丁威(terbam)(別名)+TX、
 司替羅磷(777)+TX、三氯殺蟎砒(tetradifon)(786)+TX、殺蟎黴素(tetranactin)
 (別名)(653)+TX、殺蟎硫醚(tetrasul)(1425)+TX、久效威(thiafenox)
 (別名)+TX、抗蟲威(thiocarboxime)(1431)+TX、久效威(thiofanox)(800)
 +TX、甲基乙拌磷(thiometon)(801)+TX、克殺蟎(1436)+TX、蘇力菌
 素(thuringiensin)(別名)[CCN]+TX、威菌磷(triamphos)(1441)+TX、
 苯噻蟎(triarathene)(1443)+TX、三唑磷(820)+TX、啞呀威(triazuron)
 (別名)+TX、敵百蟲(824)+TX、氯苯乙丙磷(trifenofos)(1455)+TX、
 甲殺蟎黴素(trinactin)(別名)(653)+TX、滅蚜硫磷(847)+TX、氟吡啶
 蟲(vaniliprole)[CCN]和YI-5302(化合物代碼)+TX、

殺藻劑，該殺藻劑選自由以下組成的物質組：百殺辛(bethoxazin)[CCN]+
 TX、二辛酸銅(IUPAC名稱)(170)+TX、硫酸銅(172)+TX、cybutryne[CCN]

+ TX、二氯萘醌 (dichlone) (1052) + TX、雙氯酚 (232) + TX、菌多酸 (295) + TX、三苯錫 (fentin) (347) + TX、熟石灰[CCN] + TX、代森鈉 (nabam) (566) + TX、滅藻醌 (quinoclamine) (714) + TX、醌苳胺 (quinonamid) (1379) + TX、西瑪津 (730) + TX、三苯基乙酸錫 (IUPAC名稱) (347) 和三苯基氫氧化錫 (IUPAC名稱) (347) + TX，

驅蠕蟲劑，該驅蠕蟲劑選自由以下組成的物質組：阿巴美丁 (1) + TX、克蘆磷酯 (1011) + TX、朵拉克汀 (別名) [CCN] + TX、依馬克丁 (291) + TX、依馬克丁苯甲酸酯 (291) + TX、依立諾克丁 (別名) [CCN] + TX、伊維菌素 (別名) [CCN] + TX、米爾貝肱 (別名) [CCN] + TX、莫昔克丁 (別名) [CCN] + TX、哌吡 [CCN] + TX、塞拉菌素 (selamectin) (別名) [CCN] + TX、多殺菌素 (737) 和托布津 (thiophanate) (1435) + TX，

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

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

黴素（744）+ TX、鏈黴素倍半硫酸鹽（744）+ TX、葉枯猷（766）+ TX、和硫柳汞（別名）[CCN]+ TX，

生物試劑，該生物試劑選自由以下組成的物質組：棉褐帶卷蛾顆粒體病毒（*Adoxophyes orana* GV）（別名）（12）+ TX、放射形土壤桿菌（別名）（13）+ TX、鈍綏蟎屬物種（*Amblyseius* spp.）（別名）（19）+ TX、芹菜夜蛾核多角體病毒（*Anagrapha falcifera* NPV）（別名）（28）+ TX、*Anagrus atomus*（別名）（29）+ TX、短距蚜小蜂（*Aphelinus abdominalis*）（別名）（33）+ TX、棉蚜寄生蜂（*Aphidius colemani*）（別名）（34）+ TX、食蚜瘿蚊（*Aphidoletes aphidimyza*）（別名）（35）+ TX、苜蓿銀紋夜蛾核多角體病毒（*Autographa californica* NPV）（別名）（38）+ TX、堅硬芽孢桿菌（*Bacillus firmus*）（別名）（48）+ TX、球形芽孢桿菌（*Bacillus sphaericus* Neide）（學名）（49）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌（*Bacillus thuringiensis* Berliner）（學名）（51）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌鯨澤亞種（*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*）（學名）（51）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌以色列亞種（*Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*）（學名）（51）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌日本亞種（*Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis*）（學名）（51）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克亞種（*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*）（學名）（51）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌擬步行甲亞種（*Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*）（學名）（51）+ TX、球孢白僵菌（*Beauveria bassiana*）（別名）（53）+ TX、布氏白僵菌（*Beauveria brongniartii*）（別名）（54）+ TX、草蜻蛉（*Chrysoperla carnea*）（別名）（151）+ TX、孟氏隱唇瓢蟲（*Cryptolaemus montrouzieri*）（別名）（178）+ TX、蘋果蠹蛾顆粒體病毒（*Cydia pomonella* GV）（別名）（191）+ TX、西伯利亞離顎繭蜂（*Dacnusa sibirica*）（別名）（212）+ TX、豌豆潛葉蠅姬小蜂（*Diglyphus isaea*）（別名）（254）+ TX、麗蚜小蜂（*Encarsia formosa*）（學名）（293）+ TX、槲角蚜小蜂（*Eretmocerus eremicus*）

(別名) (300) + TX、玉米穗夜蛾核多角體病毒 (*Helicoverpa zea* NPV) (別名) (431) + TX、嗜菌異小桿線蟲 (*Heterorhabditis bacteriophora*) 和 *H. megidis* (別名) (433) + TX、會聚長足瓢蟲 (*Hippodamia convergens*) (別名) (442) + TX、橘粉介殼蟲寄生蜂 (*Leptomastix dactylopii*) (別名) (488) + TX、盲蝽 (*Macrolophus caliginosus*) (別名) (491) + TX、甘藍夜蛾核多角體病毒 (*Mamestra brassicae* NPV) (別名) (494) + TX、*Metaphycus helvolus* (別名) (522) + TX、黃綠綠僵菌 (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) (學名) (523) + TX、金龜子綠僵菌小孢變種 (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) (學名) (523) + TX、松黃葉蜂 (*Neodiprion sertifer*) 核多角體病毒和紅頭松樹葉蜂 (*N. lecontei*) 核多角體病毒 (別名) (575) + TX、小花蝽屬物種 (別名) (596) + TX、玫菸色擬青黴 (*Paecilomyces fumosoroseus*) (別名) (613) + TX、智利捕植蟎 (*Phytoseiulus persimilis*) (別名) (644) + TX、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua* multicapsid) 多核衣殼核多角體病毒 (學名) (741) + TX、毛蚊線蟲 (*Steinernema bibionis*) (別名) (742) + TX、小卷蛾斯氏線蟲 (*Steinernema carpocapsae*) (別名) (742) + TX、夜蛾斯氏線蟲 (別名) (742) + TX、*Steinernema glaseri* (別名) (742) + TX、*Steinernema riobrave* (別名) (742) + TX、*Steinernema riobrave* (別名) (742) + TX、*Steinernema scapterisci* (別名) (742) + TX、斯氏線蟲屬物種 (*Steinernema* spp.) (別名) (742) + TX、赤眼蜂屬物種 (別名) (826) + TX、西方盲走蟎 (*Typhlodromus occidentalis*) (別名) (844) 和蠟蚧輪枝菌 (*Verticillium lecanii*) (別名) (848) + TX，

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

化學不育劑，該化學不育劑選自由以下組成的物質組：啞磷吡 (apholate) [CCN] + TX、雙(氮丙啶)甲胺基磷硫化物 (bisazir) (別名) [CCN] + TX、白消

安(別名)[CCN]+TX、除蟲脲(250)+TX、迪麥替夫(dimatif)(別名)[CCN]+TX、六甲蜜胺(hemel)[CCN]+TX、六甲磷(hempa)[CCN]+TX、甲基涕巴(metepa)[CCN]+TX、甲硫涕巴(methiotepa)[CCN]+TX、甲基不育特(methylapholate)[CCN]+TX、不孕啞(morzid)[CCN]+TX、氟幼脲(penfluron)(別名)[CCN]+TX、涕巴(tepa)[CCN]+TX、硫代六甲磷(thiohempa)(別名)[CCN]+TX、硫涕巴(別名)[CCN]+TX、曲他胺(別名)[CCN]和尿烷亞胺(別名)[CCN]+TX、

昆蟲資訊素，該昆蟲資訊素選自由以下組成的物質組：*(E)*-癸-5-烯-1-基乙酸酯與*(E)*-癸-5-烯-1-醇(IUPAC名稱)(222)+TX、*(E)*-十三碳-4-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名稱)(829)+TX、*(E)*-6-甲基庚-2-烯-4-醇(IUPAC名稱)(541)+TX、*(E,Z)*-十四碳-4,10-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名稱)(779)+TX、*(Z)*-十二碳-7-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名稱)(285)+TX、*(Z)*-十六碳-11-烯醛(IUPAC名稱)(436)+TX、*(Z)*-十六碳-11-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名稱)(437)+TX、*(Z)*-十六碳-13-烯-11-炔-1-基乙酸酯(IUPAC名稱)(438)+TX、*(Z)*-二十-13-烯-10-酮(IUPAC名稱)(448)+TX、*(Z)*-十四碳-7-烯-1-醛(IUPAC名稱)(782)+TX、*(Z)*-十四碳-9-烯-1-醇(IUPAC名稱)(783)+TX、*(Z)*-十四碳-9-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名稱)(784)+TX、*(7E,9Z)*-十二碳-7,9-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名稱)(283)+TX、*(9Z,11E)*-十四碳-9,11-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名稱)(780)+TX、*(9Z,12E)*-十四碳-9,12-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名稱)(781)+TX、14-甲基十八碳-1-烯(IUPAC名稱)(545)+TX、4-甲基壬-5-醇與4-甲基壬-5-酮(IUPAC名稱)(544)+TX、 α -多紋素(alpha-multistriatin)(別名)[CCN]+TX、西部松小蠹集合資訊素(brevicommin)(別名)[CCN]+TX、十二碳二烯醇(codlure)(別名)[CCN]+TX、可得蒙(codlemone)(別名)(167)+TX、誘蠅酮(cuelure)(別名)(179)+TX、環氧十九烷(disparlure)(277)+TX、

十二碳-8-烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名稱) (286) + TX、十二碳-9-烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名稱) (287) + TX、十二碳-8 + TX、10-二烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名稱) (284) + TX、dominicalure (別名) [CCN] + TX、4-甲基辛酸乙酯 (IUPAC名稱) (317) + TX、丁香酚 (別名) [CCN] + TX、南部松小蠹集合資訊素 (frontalin) (別名) [CCN] + TX、誘蟲十六酯 (gossyplure) (別名) (420) + TX、誘殺烯混劑 (grandlure) (421) + TX、誘殺烯混劑I (別名) (421) + TX、誘殺烯混劑II (別名) (421) + TX、誘殺烯混劑III (別名) (421) + TX、誘殺烯混劑IV (別名) (421) + TX、己誘劑 (hexalure) [CCN] + TX、齒小蠹二烯醇 (ipsdienol) (別名) [CCN] + TX、小蠹烯醇 (ipsenol) (別名) [CCN] + TX、金龜子性誘劑 (japonilure) (別名) (481) + TX、三甲基二氧三環壬烷 (別名) [CCN] + TX、litlure (別名) [CCN] + TX、粉紋夜蛾性誘劑 (looplure) (別名) [CCN] + TX、誘殺酯 (medlure) [CCN] + TX、megatomoic acid (別名) [CCN] + TX、誘蟲醚 (methyl eugenol) (別名) (540) + TX、誘蟲烯 (muscalure) (563) + TX、十八碳-2,13-二烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名稱) (588) + TX、十八碳-3,13-二烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名稱) (589) + TX、賀康彼 (orfralure) (別名) [CCN] + TX、椰蛀犀金龜聚集信息素 (oryctalure) (別名) (317) + TX、非樂康 (ostramone) (別名) [CCN] + TX、誘蟲環 (siglure) [CCN] + TX、sordidin (別名) (736) + TX、食菌甲誘醇 (sulcatol) (別名) [CCN] + TX、十四碳-11-烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名稱) (785) + TX、地中海實蠅引誘劑 (839) + TX、地中海實蠅引誘劑A (別名) (839) + TX、地中海實蠅引誘劑B₁ (別名) (839) + TX、地中海實蠅引誘劑B₂ (別名) (839) + TX、地中海實蠅引誘劑C (別名) (839) 和trunc-call (別名) [CCN] + TX，

昆蟲驅避劑，該昆蟲驅避劑選自由以下組成的物質組：2-(辛基硫代)乙醇 (IUPAC名稱) (591) + TX、避蚊酮 (butopyronoxyl) (933) + TX、丁氧基(聚

丙二醇) (936) + TX、己二酸二丁酯 (IUPAC名稱) (1046) + TX、鄰苯二甲酸二丁酯(1047)+ TX、丁二酸二丁酯(IUPAC名稱)(1048)+ TX、避蚊胺 [CCN] + TX、驅蚊酯 (dimethyl carbate) [CCN] + TX、鄰苯二甲酸二甲酯 [CCN] + TX、乙基己二醇 (1137) + TX、己脲 [CCN] + TX、甲嗪丁 (methoquin-butyl) (1276) + TX、甲基新癸醯胺 [CCN] + TX、草醯胺酸酯 (oxamate) [CCN] 和羥哌酯 [CCN] + TX，

殺昆蟲劑，該殺昆蟲劑選自由以下組成的物質組：1-二氯-1-硝基乙烷 (IUPAC/化學文摘名稱) (1058) + TX、1,1-二氯-2,2-二(4-乙基苯基)乙烷 (IUPAC名稱) (1056) + TX、1,2-二氯丙烷 (IUPAC/化學文摘名稱) (1062) + TX、帶有1,3-二氯丙烯的1,2-二氯丙烷 (IUPAC名稱) (1063) + TX、1-溴-2-氯乙烷 (IUPAC/化學文摘名稱) (916) + TX、乙酸2,2,2-三氯-1-(3,4-二氯苯基)乙基酯 (IUPAC名稱) (1451) + TX、2,2-二氯乙烯基2-乙基亞磺醯基乙基甲基磷酸酯 (IUPAC名稱) (1066) + TX、二甲基胺基甲酸2-(1,3-二硫雜環戊烷-2-基)苯基酯 (IUPAC/化學文摘名稱) (1109) + TX、硫氰酸2-(2-丁氧基乙氧基)乙基酯 (IUPAC/化學文摘名稱) (935) + TX、甲基胺基甲酸2-(4,5-二甲基-1,3-二氧環戊烷-2-基)苯基酯 (IUPAC/化學文摘名稱) (1084) + TX、2-(4-氯-3,5-二甲苯基氧基)乙醇 (IUPAC名稱) (986) + TX、2-氯乙烯基二乙基磷酸酯 (IUPAC名稱) (984) + TX、2-咪唑啉酮 (IUPAC名稱) (1225) + TX、2-異戊醯基二氫茚-1,3-二酮 (IUPAC名稱) (1246) + TX、甲基胺基甲酸2-甲基(丙-2-炔基)胺基苯基酯 (IUPAC名稱) (1284) + TX、月桂酸2-硫氰基乙基酯 (IUPAC名稱) (1433) + TX、3-溴-1-氯丙-1-烯 (IUPAC名稱) (917) + TX、二甲基胺基甲酸3-甲基-1-苯基吡啶-5-基酯 (IUPAC名稱) (1283) + TX、甲基胺基甲酸4-甲基(丙-2-炔基)胺基-3,5-二甲苯基酯 (IUPAC名稱) (1285) + TX、二甲基胺基甲酸5,5-二甲基-3-側氧基環己-1-烯基酯 (IUPAC名稱) (1085) + TX、阿巴美丁 (1) + TX、

乙醯甲胺磷 (2) + TX、啖蟲脒 (4) + TX、家蠅磷 (別名) [CCN] + TX、乙醯
 蟲脒[CCN] + TX、氟丙菊酯 (9) + TX、丙烯腈 (IUPAC名稱) (861) + TX、
 棉鈴威 (15) + TX、涕滅威 (16) + TX、涕滅虱威 (863) + TX、氯甲橋萘 (864)
 + TX、烯丙菊酯 (17) + TX、阿洛胺菌素 (別名) [CCN] + TX、除害威 (866)
 + TX、 α -氯氰菊酯 (202) + TX、 α -蛻皮激素 (別名) [CCN] + TX、磷化鋁 (640)
 + TX、賽硫磷 (870) + TX、硫代醯胺 (872) + TX、滅害威 (873) + TX、胺
 吸磷 (875) + TX、胺吸磷草酸氫鹽 (875) + TX、雙甲脒 (24) + TX、新菸鹼
 (877) + TX、乙基殺撲磷 (883) + TX、AVI 382 (化合物代碼) + TX、AZ 60541
 (化合物代碼) + TX、印棟素 (別名) (41) + TX、甲基吡啶磷 (42) + TX、
 穀硫磷-乙基 (44) + TX、穀硫磷-甲基 (45) + TX、偶氮磷 (889) + TX、蘇雲
 金芽孢桿菌 δ 內毒素類 (別名) (52) + TX、六氟矽酸鋇 (別名) [CCN] + TX、
 多硫化鋇 (IUPAC/化學文摘名稱) (892) + TX、熏菊酯[CCN] + TX、Bayer 22/190
 (發展代碼) (893) + TX、Bayer 22408 (發展代碼) (894) + TX、惡蟲威 (58)
 + TX、丙硫克百威 (60) + TX、殺蟲磺 (66) + TX、 β 氟氯氰菊酯 (194) + TX、
 β -氯氰菊酯 (203) + TX、聯苯菊酯 (76) + TX、生物烯丙菊酯 (78) + TX、生
 物烯丙菊酯S-環戊烯基異構物 (別名) (79) + TX、戊環苄呋菊酯
 (bioethanomethrin) [CCN] + TX、生物氯菊酯 (908) + TX、除蟲菊酯 (80) + TX、
 二(2-氯乙基)醚 (IUPAC名稱) (909) + TX、雙三氟蟲脒 (83) + TX、硼砂 (86)
 + TX、溴滅菊酯 (別名) + TX、溴苯烯磷 (914) + TX、溴殺烯 (918) + TX、
 溴-DDT (別名) [CCN] + TX、溴硫磷 (920) + TX、溴硫磷-乙基 (921) + TX、
 合殺威 (924) + TX、噻吡酮 (99) + TX、畜蟲威 (926) + TX、脫甲基丁噻啶
 磷 (butathiofos) (927) + TX、丁酮威 (103) + TX、丁酯磷 (932) + TX、丁
 酮虱威 (104) + TX、丁基噻蟎酮 (別名) + TX、硫線磷 (109) + TX、磷酸鈣[CCN]
 + TX、氰化鈣 (444) + TX、多硫化鈣 (IUPAC名稱) (111) + TX、毒殺芬 (941)

+ TX、氯滅殺威 (943) + TX、甲萘威 (115) + TX、克百威 (118) + TX、二硫化碳 (IUPAC/化學文摘名稱) (945) + TX、四氯化碳 (IUPAC名稱) (946) + TX、三硫磷 (947) + TX、丁硫克百威 (119) + TX、殺螟丹 (123) + TX、殺螟丹鹽酸鹽 (123) + TX、西伐丁 (別名) (725) + TX、冰片丹 (960) + TX、氯丹 (128) + TX、開蓬 (963) + TX、殺蟲脒 (964) + TX、殺蟲脒鹽酸鹽 (964) + TX、氯氧磷 (129) + TX、溴蟲腈 (130) + TX、毒蟲畏 (131) + TX、定蟲隆 (132) + TX、氯甲磷 (136) + TX、氯仿[CCN] + TX、氯化苦烷 (141) + TX、氯辛硫磷 (989) + TX、滅蟲吡啶 (990) + TX、毒死蜱 (145) + TX、毒死蜱-甲基 (146) + TX、蟲蟊磷 (994) + TX、環蟲醯肼 (150) + TX、灰菊素I (696) + TX、灰菊素II (696) + TX、灰菊素類 (696) + TX、順式苜呋菊酯 (cis-resmethrin) (別名) + TX、順式苜呋菊酯 (cismethrin) (80) + TX、功夫菊酯 (別名) + TX、除線威 (999) + TX、氯氰碘柳胺 (別名) [CCN] + TX、噻蟲胺 (165) + TX、乙醯亞砷酸銅[CCN] + TX、砷酸銅[CCN] + TX、油酸銅[CCN] + TX、蠅毒磷 (174) + TX、畜蟲磷 (1006) + TX、克羅米通 (別名) [CCN] + TX、巴毒磷 (1010) + TX、克蘆磷酯 (1011) + TX、冰晶石 (別名) (177) + TX、CS 708 (發展代碼) (1012) + TX、苯腈磷 (1019) + TX、殺螟睛 (184) + TX、果蟲磷 (1020) + TX、環蟲菊酯[CCN] + TX、乙氰菊酯 (188) + TX、氟氯氰菊酯 (193) + TX、三氯氟氰菊酯 (196) + TX、氯氰菊酯 (201) + TX、苯氰菊酯 (206) + TX、環丙馬秦 (209) + TX、畜蜱磷 (別名) [CCN] + TX、d-檸檬烯 (別名) [CCN] + TX、d-四甲菊酯 (別名) (788) + TX、DAEP (1031) + TX、棉隆 (216) + TX、DDT (219) + TX、單甲基克百威(decarbofuran) (1034) + TX、溴氰菊酯 (223) + TX、田樂磷 (1037) + TX、田樂磷-O (1037) + TX、田樂磷-S (1037) + TX、內吸磷 (1038) + TX、內吸磷-甲基 (224) + TX、內吸磷-O (1038) + TX、內吸磷-O-甲基 (224) + TX、內吸磷-S (1038) + TX、內吸磷-S-甲基 (224) + TX、內

吸磷-S-甲基磷 (1039) + TX、丁醚脲 (226) + TX、氯亞胺硫磷 (1042) + TX、
 二胺磷 (1044) + TX、二吡磷 (227) + TX、異氯磷 (1050) + TX、除線磷 (1051)
 + TX、敵敵畏 (236) + TX、迪克力弗斯 (dicliphos) (別名) + TX、迪克萊賽
 爾 (dicresyl) (別名) [CCN] + TX、百治磷 (243) + TX、地昔尼爾 (244) + TX、
 狄氏劑 (1070) + TX、二乙基 5-甲基吡啶-3-基 磷酸酯 (IUPAC名稱) (1076)
 + TX、除蟲脲 (250) + TX、二羥丙茶鹼 (dilor) (別名) [CCN] + TX、四氟甲
 醚菊酯 [CCN] + TX、甲氟磷 (1081) + TX、地麥威 (1085) + TX、樂果 (262)
 + TX、苜菊酯 (1083) + TX、甲基毒蟲畏 (265) + TX、敵蠅威 (1086) + TX、
 消蟎酚 (1089) + TX、消蟎酚 (dinex-diclexine) (1089) + TX、丙硝酚 (1093)
 + TX、戊硝酚 (1094) + TX、達諾殺 (1095) + TX、呋蟲胺 (271) + TX、苯
 蟲醚 (1099) + TX、蔬果磷 (1100) + TX、二氧威 (1101) + TX、敵惡磷 (1102)
 + TX、乙拌磷 (278) + TX、苯噻乙雙硫磷 (dithicrofos) (1108) + TX、DNOC
 (282) + TX、朵拉克汀 (別名) [CCN] + TX、DSP (1115) + TX、蛻皮激素 (別
 名) [CCN] + TX、EI 1642 (發展代碼) (1118) + TX、依馬克丁 (291) + TX、
 依馬克丁苯甲酸鹽 (291) + TX、EMPC (1120) + TX、烯炔菊酯 (292) + TX、
 硫丹 (294) + TX、因毒磷 (1121) + TX、異狄氏劑 (1122) + TX、EPBP (1123)
 + TX、EPN (297) + TX、保幼醚 (1124) + TX、依立諾克丁 (別名) [CCN] + TX、
 高氰戊菊酯 (302) + TX、牛津郡丙硫磷 (etaphos) (別名) [CCN] + TX、乙硫
 苯威 (308) + TX、乙硫磷 (309) + TX、乙蟲腈 (310) + TX、益硫磷-甲基 (1134)
 + TX、滅線磷 (312) + TX、甲酸乙酯 (IUPAC名稱) [CCN] + TX、乙基-DDD
 (別名) (1056) + TX、二溴化乙烯 (316) + TX、二氯化乙烯 (化學名稱) (1136)
 + TX、環氧乙烷 [CCN] + TX、醚菊酯 (319) + TX、乙嘧硫磷 (1142) + TX、EXD
 (1143) + TX、胺磺磷 (323) + TX、苯線磷 (326) + TX、抗蟎啞 (1147) + TX、
 皮蠅磷 (1148) + TX、苯硫威 (1149) + TX、芬氟司林 (1150) + TX、殺螟硫

磷 (335) + TX、丁苯威 (336) + TX、嘧啶蟲胺 (fenoxacrim) (1153) + TX、
 苯氧威 (340) + TX、吡氯氰菊酯 (1155) + TX、甲氰菊酯 (342) + TX、吡蟊
 胺 (fenpyrad) (別名) + TX、豐索磷 (1158) + TX、倍硫磷 (346) + TX、倍
 硫磷-乙基 [CCN] + TX、氰戊菊酯 (349) + TX、氟蟲脞 (354) + TX、氟啶蟲
 醯胺 (358) + TX、氟蟲醯胺 (CAS登記號: 272451-65-7) + TX、伏康脲 (flucofuron)
 (1168) + TX、氟環脲 (366) + TX、氟氰戊菊酯 (367) + TX、聯氟蟊 (1169)
 + TX、嘧蟲胺 [CCN] + TX、氟蟲脲 (370) + TX、三氟醚菊酯 (1171) + TX、
 氟氯苯菊酯 (372) + TX、氟胺氰菊酯 (1184) + TX、FMC 1137 (發展代碼)
 (1185) + TX、地蟲磷 (1191) + TX、伐蟲脛 (405) + TX、伐蟲脛鹽酸鹽 (405)
 + TX、安硫磷 (1192) + TX、藻蟊威 (formparanate) (1193) + TX、丁苯硫磷
 (1194) + TX、福司吡酯 (1195) + TX、噻啉酮磷 (408) + TX、丁硫環磷 (1196)
 + TX、呋線威 (412) + TX、抗蟲菊 (1200) + TX、 γ -三氯氟氰菊酯 (197) + TX、
 γ -HCH (430) + TX、雙胍鹽 (422) + TX、雙胍醋酸鹽 (422) + TX、GY-81 (發
 展代碼) (423) + TX、苜蟊醚 (424) + TX、氯蟲醯脒 (425) + TX、HCH (430)
 + TX、HEOD (1070) + TX、飛布達 (1211) + TX、庚烯磷 (432) + TX、速殺
 硫磷 [CCN] + TX、氟鈴脲 (439) + TX、HHDN (864) + TX、氟蟻脲 (443) + TX、
 氫氰酸 (444) + TX、烯蟲乙酯 (445) + TX、海驅威 (hyquincarb) (1223) + TX、
 吡蟲啉 (458) + TX、炔咪菊酯 (460) + TX、茚蟲威 (465) + TX、碘甲烷 (IUPAC
 名稱) (542) + TX、IPSP (1229) + TX、氯啉磷 (1231) + TX、碳氯靈 (1232)
 + TX、水胺硫磷 (別名) (473) + TX、異艾氏劑 (1235) + TX、異柳磷 (1236)
 + TX、移栽靈 (1237) + TX、異丙威 (472) + TX、O-(甲氧基胺基硫代磷醯基)
 水楊酸異丙酯 (IUPAC名稱) (473) + TX、稻瘟靈 (474) + TX、異拌磷 (1244)
 + TX、惡啉磷 (480) + TX、伊維菌素 (別名) [CCN] + TX、茚酮菊素I (696)
 + TX、茚酮菊素II (696) + TX、碘硫磷 (1248) + TX、保幼激素I (別名) [CCN]

+ TX、保幼激素II（別名）[CCN] + TX、保幼激素III（別名）[CCN] + TX、氯戊環（1249）+ TX、烯蟲炔酯（484）+ TX、λ-三氯氟氰菊酯（198）+ TX、砷酸鉛[CCN] + TX、雷皮菌素（CCN）+ TX、對溴磷（1250）+ TX、林旦（430）+ TX、丙噻硫磷（lirimfos）（1251）+ TX、虱蟎脲（490）+ TX、噻唑磷（1253）+ TX、間異丙基苯基 甲基胺基甲酸酯(IUPAC名稱)(1014)+ TX、磷化鎂(IUPAC名稱)（640）+ TX、馬拉硫磷（492）+ TX、苜丙二腈（1254）+ TX、疊氮磷（1255）+ TX、滅加松（502）+ TX、四甲磷（1258）+ TX、滅蚜硫磷（1260）+ TX、地安磷（1261）+ TX、氯化亞汞（513）+ TX、線蟲靈（mesulfenfos）（1263）+ TX、氰氟蟲脞（CCN）+ TX、威百畝（519）+ TX、威百畝鉀（別名）（519）+ TX、威百畝鈉（519）+ TX、蟲蟎畏（1266）+ TX、甲胺磷（527）+ TX、甲烷磺醯氟（IUPAC/化學文摘名稱）（1268）+ TX、殺撲磷（529）+ TX、滅賜克（530）+ TX、殺蟲乙烯磷（1273）+ TX、滅多威（531）+ TX、烯蟲酯（532）+ TX、甲嗪丁（1276）+ TX、甲醚菊酯（別名）（533）+ TX、甲氧滴滴涕（534）+ TX、甲氧苯醯（535）+ TX、溴甲烷（537）+ TX、異硫氰酸甲酯（543）+ TX、甲基氯仿（別名）[CCN] + TX、二氯甲烷[CCN] + TX、甲氧苄氟菊酯[CCN] + TX、速滅威（550）+ TX、惡蟲酮（1288）+ TX、美文松（556）+ TX、茲克威（1290）+ TX、密滅汀（557）+ TX、米爾倍黴素（別名）[CCN] + TX、丙胺氟磷（1293）+ TX、滅蟻靈（1294）+ TX、久效磷（561）+ TX、茂硫磷（1300）+ TX、莫昔克丁（別名）[CCN] + TX、萘酞磷（別名）[CCN] + TX、二溴磷（567）+ TX、萘（IUPAC/化學文摘名稱）（1303）+ TX、NC-170（發展代碼）（1306）+ TX、NC-184（化合物代碼）+ TX、菸鹼（578）+ TX、硫酸菸鹼（578）+ TX、氟蟻靈（1309）+ TX、烯啶蟲胺（579）+ TX、硝乙脲噻唑（nithiazine）（1311）+ TX、戊氰威（1313）+ TX、戊氰威1:1氯化鋅錯合物（1313）+ TX、NNI-0101（化合物代碼）+ TX、NNI-0250（化合物代碼）+ TX、降菸鹼（慣用名）（1319）+ TX、

雙苯氟脲 (585) + TX、多氟脲 (586) + TX、O-5-二氯-4-碘苯基 O-乙基 乙基硫
 代磷酸酯 (IUPAC名稱) (1057) + TX、O,O-二乙基 O-4-甲基-2-側氧基-2H-色
 烯-7-基 硫代磷酸酯 (IUPAC名稱) (1074) + TX、O,O-二乙基 O-6-甲基-2-丙基
 嘧啶-4-基 硫代磷酸酯 (IUPAC名稱) (1075) + TX、O,O,O',O'-四丙基 二硫代
 焦磷酸酯 (IUPAC名稱) (1424) + TX、油酸 (IUPAC名稱) (593) + TX、氧
 化樂果 (594) + TX、殺線威 (602) + TX、砒吸磷-甲基 (609) + TX、異亞砒
 磷 (1324) + TX、砒拌磷 (1325) + TX、pp'-DDT (219) + TX、對-二氯苯[CCN]
 + TX、對硫磷 (615) + TX、對硫磷-甲基 (616) + TX、氟幼脲 (別名) [CCN]
 + TX、五氯苯酚 (623) + TX、月桂酸五氯苯基酯 (IUPAC名稱) (623) + TX、
 氯菊酯 (626) + TX、石油油料類 (別名) (628) + TX、PH 60-38 (發展代碼)
 (1328) + TX、芬硫磷 (1330) + TX、苯醚菊酯 (630) + TX、稻豐散 (631) +
 TX、甲拌磷 (636) + TX、伏殺硫磷 (637) + TX、硫環磷 (1338) + TX、亞胺
 硫磷 (638) + TX、對氯硫磷 (1339) + TX、磷胺 (639) + TX、磷化氫 (IUPAC
 名稱) (640) + TX、辛硫磷 (642) + TX、辛硫磷-甲基 (1340) + TX、甲胺基
 嘧啶磷(pirimetaphos) (1344) + TX、抗蚜威 (651) + TX、蟲蟊磷-乙基 (1345)
 + TX、蟲蟊磷-甲基 (652) + TX、聚氯二環戊二烯異構物類 (IUPAC名稱) (1346)
 + TX、聚氯萘類 (慣用名) (1347) + TX、亞砷酸鉀[CCN] + TX、硫氰酸鉀[CCN]
 + TX、丙炔菊酯 (655) + TX、早熟素I (別名) [CCN] + TX、早熟素II (別名)
 [CCN] + TX、早熟素III (別名) [CCN] + TX、乙醯嘧啶磷 (primidophos) (1349)
 + TX、丙溴磷 (662) + TX、丙氟菊酯[CCN] + TX、蜚虱威 (1354) + TX、猛
 殺威 (1355) + TX、丙蟲磷 (1356) + TX、胺丙畏 (673) + TX、殘殺威 (678)
 + TX、乙噻唑磷 (1360) + TX、丙硫磷 (686) + TX、發硫磷 (1362) + TX、
 丙苯炔菊酯 (protrifenbute) [CCN] + TX、吡蚜酮 (688) + TX、吡唑硫磷 (689)
 + TX、定菌磷 (693) + TX、苜呋菊酯 (pyresmethrin) (1367) + TX、除蟲菊

酯I (696) + TX、除蟲菊酯II (696) + TX、除蟲菊酯類 (696) + TX、噻蟎靈 (699) + TX、啉蟲丙醚 (700) + TX、嗒吡硫磷 (701) + TX、噻蟎醚 (706) + TX、噻硫磷 (1370) + TX、吡丙醚 (708) + TX、苦木提取物 (quassia) (別名) [CCN] + TX、喹硫磷 (quinalphos) (711) + TX、喹硫磷-甲基 (1376) + TX、畜寧磷 (1380) + TX、喹硫磷 (quintiofos) (1381) + TX、R-1492 (發展代碼) (1382) + TX、雷複尼特 (別名) [CCN] + TX、苜呋菊酯 (719) + TX、魚藤酮 (722) + TX、RU 15525 (發展代碼) (723) + TX、RU 25475 (發展代碼) (1386) + TX、尼亞那 (ryania) (別名) (1387) + TX、利阿諾定 (慣用名) (1387) + TX、沙巴黎蘆 (別名) (725) + TX、八甲磷 (1389) + TX、硫線磷 (別名) + TX、塞拉菌素 (別名) [CCN] + TX、SI-0009 (化合物代碼) + TX、SI-0205 (化合物代碼) + TX、SI-0404 (化合物代碼) + TX、SI-0405 (化合物代碼) + TX、氟矽菊酯 (728) + TX、SN 72129 (發展代碼) (1397) + TX、亞砷酸鈉 [CCN] + TX、氰化鈉 (444) + TX、氟化鈉 (IUPAC/化學文摘名稱) (1399) + TX、六氟矽酸鈉 (1400) + TX、五氯酚鈉 (623) + TX、硒酸鈉 (IUPAC名稱) (1401) + TX、硫氰酸鈉 [CCN] + TX、蘇硫磷 (1402) + TX、多殺菌素 (737) + TX、螺甲蟎酯 (739) + TX、螺蟲乙酯 (CCN) + TX、薩爾科福隆 (sulcofuron) (746) + TX、薩爾科福隆鈉 (sulcofuron-sodium) (746) + TX、氟蟲胺 (750) + TX、治螟磷 (753) + TX、磺醯氟 (756) + TX、硫丙磷 (1408) + TX、焦油類 (別名) (758) + TX、 τ -氟胺氰菊酯 (398) + TX、噻蟎威 (1412) + TX、TDE (1414) + TX、蟲醯肼 (762) + TX、吡蟎胺 (763) + TX、丁基噻啉磷 (764) + TX、氟苯脲 (768) + TX、七氟菊酯 (769) + TX、雙硫磷 (770) + TX、TEPP (1417) + TX、環戊烯丙菊酯 (1418) + TX、三級丁威 (terbam) (別名) + TX、特丁硫磷 (773) + TX、四氯乙烷 [CCN] + TX、殺蟲畏 (777) + TX、四甲菊酯 (787) + TX、 θ 氯氰菊酯 (204) + TX、噻蟲啉 (791) + TX、塞芬諾克斯 (thiafenox) (別名)

+ TX、噻蟲吡 (792) + TX、苯噻硫磷 (thicrofos) (1428) + TX、克蟲威 (1431) + TX、殺蟲環 (798) + TX、殺蟲環草酸氫鹽 (798) + TX、硫雙威 (799) + TX、久效威 (800) + TX、甲基乙拌磷 (801) + TX、蟲線磷 (1434) + TX、殺蟲單 (thiosultap) (803) + TX、殺蟲雙 (thiosultap-sodium) (803) + TX、蘇雲金素 (別名) [CCN] + TX、啞蟲醯胺 (809) + TX、四溴菊酯 (812) + TX、四氟苯菊酯 (813) + TX、反式苄氯菊酯 (transpermethrin) (1440) + TX、威菌磷 (1441) + TX、啞蚜威 (818) + TX、三唑磷 (820) + TX、啞呀威 (別名) + TX、敵百蟲 (824) + TX、三氯偏磷酸-3 (trichlormetaphos-3) (別名) [CCN] + TX、毒壤磷 (1452) + TX、三氯丙氧磷 (1455) + TX、殺鈴脲 (835) + TX、混殺威 (840) + TX、烯蟲硫酯 (1459) + TX、蚜滅磷 (847) + TX、甲烯氟蟲腈 (vaniliprole) [CCN] + TX、藜蘆定 (別名) (725) + TX、藜蘆鹼 (別名) (725) + TX、XMC (853) + TX、滅殺威 (854) + TX、YI-5302 (化合物代碼) + TX、ζ-氯氰菊酯 (205) + TX、澤泰咪林 (zetamethrin) (別名) + TX、磷化鋅 (640) + TX、丙硫惡唑磷 (zolaprofos) (1469) 以及 ZXI 8901 (發展代碼) (858) + TX、氰蟲醯胺 [736994-63-19] + TX、氯蟲醯胺 [500008-45-7] + TX、啞蟎氰 (cyenopyrafen) [560121-52-0] + TX、丁氟蟎酯 [400882-07-7] + TX、氟蟲吡啶 (pyrifluquinazon) [337458-27-2] + TX、乙基多殺菌素 (spinetoram) [187166-40-1 + 187166-15-0] + TX、螺蟲乙酯 [203313-25-1] + TX、磺蟲啉 (sulfoxaflor) [946578-00-3] + TX、丁蟲腈 (flufiprole) [704886-18-0] + TX、氯氟醚菊酯 [915288-13-0] + TX、四氟醚菊酯 (tetramethylfluthrin) [84937-88-2] + TX、triflumezopyrim (揭露於 WO 2012/092115 中) + TX, fluxametamide (WO 2007/026965) + TX, ε-甲氧苄氟菊酯 (epsilon-metofluthrin) [240494-71-7] + TX、ε-氟氯氰菊酯 [1065124-65-3] + TX、氟氮雜吡啶 (fluazaindolizine) [1254304-22-7] + TX、氯丙炔菊酯 (chloroprallethrin) [399572-87-3] + TX、fluxametamide [928783-29-3] + TX、氯

氟氰蟲醯胺 (cyhalodiamide) [1262605-53-7] + TX、硫雜酚 (tioxazafen) [330459-31-9] + Tx、broflanilide [1207727-04-5] + TX、丁烯氟蟲腈 (flufiprole) [704886-18-0] + TX、環溴蟲醯胺 (cyclaniliprole) [1031756-98-5] + TX、氟氰蟲醯胺 [1229654-66-3] + TX、戊吡蟲胍 (描述於WO 2010/060231中) + TX、環氧蟲啉 (描述於WO 2005/077934中) + TX、四聚酸殺蟲劑 (spiropidion) + TX、啉喃環丙蟲酯 + TX、flupyrimin + TX、Momfluorothrin + TX、κ-聯苯菊酯 + TX、κ-七氟菊酯 + TX、Dichloromezotiaz + TX、Tetrachloraniliprole + TX、benzpyrimoxan + TX；

殺軟體動物劑，該殺軟體動物劑選自由以下組成的物質組：二(三丁基錫)氧化物 (IUPAC名稱) (913) + TX、溴乙醯胺 [CCN] + TX、砷酸鈣 [CCN] + TX、除線威 (cloethocarb) (999) + TX、乙醯亞砷酸銅 [CCN] + TX、硫酸銅 (172) + TX、三苯錫 (347) + TX、磷酸鐵 (IUPAC名稱) (352) + TX、四聚乙醛 (518) + TX、滅賜克 (530) + TX、氯硝柳胺 (576) + TX、氯硝柳胺乙醇胺鹽 (576) + TX、五氯酚 (623) + TX、五氯苯氧化鈉 (623) + TX、噻蟎威 (tazimcarb) (1412) + TX、硫雙威 (799) + TX、三丁基氧化錫 (913) + TX、殺螺味啉 (trifenmorph) (1454) + TX、混殺威 (trimethacarb) (840) + TX、乙酸三苯基錫 (IUPAC名稱) (347) 和三苯基氫氧化錫 (IUPAC名稱) (347) + TX、皮瑞普 (pyriprole) [394730-71-3] + TX，

殺線蟲劑，所述殺線蟲劑選自由以下組成的物質組：AKD-3088 (化合物代碼) + TX、1,2-二溴-3-氯丙烷 (IUPAC/化學文摘名稱) (1045) + TX、1,2-二氯丙烷 (IUPAC/化學文摘名稱) (1062) + TX、1,2-二氯丙烷與1,3-二氯丙烯 (IUPAC名稱) (1063) + TX、1,3-二氯丙烯 (233) + TX、3,4-二氯四氫噻吩1,1-二氧化物 (IUPAC/化學文摘名稱) (1065) + TX、3-(4-氯苯基)-5-甲基羅丹寧 (IUPAC名稱) (980) + TX、5-甲基-6-硫代-1,3,5-噻二吡咻-3-基乙酸 (IUPAC名稱) (1286)

+TX、6-異戊烯基胺基嘌呤（別名）（210）+TX、阿巴美丁（1）+TX、乙醯蟲脞[CCN]+TX、棉鈴威（15）+TX、涕滅威（aldicarb）（16）+TX、涕滅虱威（863）+TX、AZ 60541（化合物代碼）+TX、苯氯噻唑（benclonthiaz）[CCN]+TX、苯菌靈（62）+TX、丁基噻蟎酮（別名）+TX、硫線磷（109）+TX、蟲蟎威（carbofuran）（118）+TX、二硫化碳（945）+TX、丁硫克百威（119）+TX、氯化苦（141）+TX、毒死蜱（145）+TX、除線威（cloethocarb）（999）+TX、細胞分裂素（別名）（210）+TX、棉隆（216）+TX、DBCP（1045）+TX、DCIP（218）+TX、除線特（diamidafos）（1044）+TX、除線磷（1051）+TX、二克磷（dicliphos）（別名）+TX、樂果（262）+TX、朵拉菌素（doramectin）（別名）[CCN]+TX、艾瑪菌素（291）+TX、艾瑪菌素苯甲酸鹽（291）+TX、依立諾克丁（別名）[CCN]+TX、滅線磷（312）+TX、二溴化乙烯（316）+TX、克線磷（326）+TX、吡蟎胺（fenpyrad）（別名）+TX、豐索磷（1158）+TX、噻唑磷（408）+TX、丁硫環磷（1196）+TX、糠醛（別名）[CCN]+TX、GY-81（發展代碼）（423）+TX、速殺硫磷[CCN]+TX、碘甲烷（IUPAC名稱）（542）+TX、艾沙米多福（isamidofos）（1230）+TX、氯唑磷（1231）+TX、伊佛黴素（別名）[CCN]+TX、激動素（別名）（210）+TX、甲基滅蚜磷（1258）+TX、威百畝（519）+TX、威百畝鉀鹽（別名）（519）+TX、威百畝鈉鹽（519）+TX、甲基溴（537）+TX、甲基異硫氰酸酯（543）+TX、米爾貝肟（別名）[CCN]+TX、莫昔克丁（別名）[CCN]+TX、疣孢漆斑菌（*Myrothecium verrucaria*）組成物（別名）（565）+TX、NC-184（化合物代碼）+TX、草胺醯（602）+TX、甲拌磷（636）+TX、磷胺（639）+TX、磷蟲威[CCN]+TX、克線丹（別名）+TX、司拉克丁（別名）[CCN]+TX、多殺菌素（737）+TX、三級丁威（別名）+TX、特丁磷（773）+TX、四氯噻吩（IUPAC/化學文摘名稱）（1422）+TX、thiafenox（別名）+TX、硫磷磷（1434）+TX、三唑磷（820）+TX、啞蚜威（別名）+TX、二甲苯酚[CCN]+TX、YI-5302

(化合物代碼)和玉米素(別名)(210)+TX、氟噻蟲磺(fluensulfone)[318290-98-1]+TX、氟吡菌醯胺+TX,

硝化作用抑制劑,該硝化作用抑制劑選自由以下組成的物質組:乙基黃原酸鉀[CCN]以及三氯甲基吡啶(nitrapyrin)(580)+TX,

植物活化劑,該植物活化劑選自由以下組成的物質組:噻二唑素(acibenzolar)(6)+TX、噻二唑素-S-甲基(6)+TX、烯丙苯噻唑(probenazole)(658)和大虎杖(*Reynoutria sachalinensis*)提取物(別名)(720)+TX,

殺鼠劑,該殺鼠劑選自由以下組成的物質組:2-異戊醯二氫茛-1,3-二酮(IUPAC名)(1246)+TX、4-(喹啉-2-基胺基)苯磺醯胺(IUPAC名)(748)+TX、 α -氯代醇[CCN]+TX、磷化鋁(640)+TX、安妥(880)+TX、三氧化二砷(882)+TX、碳酸鋇(891)+TX、雙鼠脲(912)+TX、溴鼠隆(89)+TX、溴敵隆(91)+TX、溴鼠胺(92)+TX、氰化鈣(444)+TX、氮醛糖(127)+TX、氯鼠酮(140)+TX、膽鈣化醇(850)+TX、氯滅鼠靈(1004)+TX、克滅鼠(1005)+TX、殺鼠萘(175)+TX、殺鼠嘧啶(1009)+TX、鼠得克(246)+TX、噻鼠靈(249)+TX、敵鼠鈉(273)+TX、維生素D2(301)+TX、氟鼠靈(357)+TX、氟乙醯胺(379)+TX、鹽酸氟鼠啶(1183)+TX、鹽酸鼠樸定(1183)+TX、 γ -HCH(430)+TX、HCH(430)+TX、氫氰酸(444)+TX、碘甲烷(IUPAC名)(542)+TX、林旦(430)+TX、磷化鎂(IUPAC名)(640)+TX、甲基溴(537)+TX、鼠特靈(1318)+TX、毒鼠磷(1336)+TX、磷化氫(IUPAC名)(640)+TX、磷[CCN]+TX、殺鼠酮(1341)+TX、亞砷酸鉀[CCN]+TX、滅鼠優(1371)+TX、海蔥糖苷(1390)+TX、亞砷酸鈉[CCN]+TX、氰化鈉(444)+TX、氟乙酸鈉(735)+TX、士的寧(745)+TX、硫酸鉍[CCN]+TX、殺鼠靈(851)以及磷化鋅(640)+TX,

增效劑,該增效劑選自由以下組成的物質組:2-(2-丁氧基乙氧基)乙基胡椒

基酯 (IUPAC名) (934) + TX、5-(1,3-苯并二氧雜環戊烯-5-基)-3-己基環己-2-烯酮 (IUPAC名) (903) + TX、具有橙花三級醇的茵綠烯醇 (別名) (324) + TX、MB-599 (發展代碼) (498) + TX、MGK 264 (發展代碼) (296) + TX、增效醚 (piperonyl butoxide) (649) + TX、增效醛 (piprotal) (1343) + TX、增效酯 (propyl isomer) (1358) + TX、S421 (發展代碼) (724) + TX、增效散 (sesamex) (1393) + TX、芝麻林素 (sesasmolin) (1394) 和亞砒 (1406) + TX，

動物驅避劑，該動物驅避劑選自由以下組成的物質組：蔥醌 (32) + TX、氯醛糖 (127) + TX、環烷酸銅 [CCN] + TX、王銅 (171) + TX、二吡磷 (227) + TX、二環戊二烯 (化學名稱) (1069) + TX、雙胍辛鹽 (guazatine) (422) + TX、雙胍辛醋酸鹽 (422) + TX、滅蟲威 (530) + TX、吡啶-4-胺 (IUPAC名稱) (23) + TX、塞侖 (804) + TX、混殺威 (trimethacarb) (840) + TX、環烷酸鋅 [CCN] 和福美鋅 (856) + TX，

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

創傷保護劑，該創傷保護劑選自由以下組成的物質組：氧化汞 (512) + TX、辛噻酮 (octhilinone) (590) 和甲基硫菌靈 (802) + TX，

以及生物活性的化合物，該化合物選自由以下物質組成的群組：阿紮康唑 [60207-31-0] + TX、聯苯三唑醇 [70585-36-3] + TX、糠菌唑 [116255-48-2] + TX、環唑醇 [94361-06-5] + TX、苯醚甲環唑 [119446-68-3] + TX、烯唑醇 [83657-24-3] + TX、氟環唑 [106325-08-0] + TX、腈苯唑 [114369-43-6] + TX、氟喹唑 (fluquinconazole) [136426-54-5] + TX、氟矽唑 [85509-19-9] + TX、粉唑醇 [76674-21-0] + TX、己唑醇 [79983-71-4] + TX、抑黴唑 [35554-44-0] + TX、亞胺唑 [86598-92-7] + TX、種菌唑 [125225-28-7] + TX、葉菌唑 [125116-23-6] + TX、

腈菌唑[88671-89-0] + TX、稻瘟酯[101903-30-4] + TX、戊菌唑[66246-88-6] + TX、
丙硫菌唑[178928-70-6] + TX、啞斑脞 (pyrifenoX) [88283-41-4] + TX、丙氯靈
[67747-09-5] + TX、丙環唑[60207-90-1] + TX、矽氟唑 (simeconazole)
[149508-90-7] + TX、戊唑醇[107534-96-3] + TX、氟醚唑[112281-77-3] + TX、三
唑酮[43121-43-3] + TX、三唑酮[55219-65-3] + TX、氟菌唑[99387-89-0] + TX、
滅菌唑[131983-72-7] + TX、三環苯嘧啶醇[12771-68-5] + TX、氯苯嘧啶醇
[60168-88-9] + TX、氟氯苯嘧啶醇[63284-71-9] + TX、乙嘧吩磺酸酯 (bupirimate)
[41483-43-6] + TX、甲菌定 (dimethirimol) [5221-53-4] + TX、乙菌定 (ethirimol)
[23947-60-6] + TX、十二環咪啉[1593-77-7] + TX、苯鏽啶 (fenpropidine)
[67306-00-7] + TX、丁苯咪啉[67564-91-4] + TX、螺環菌胺[118134-30-8] + TX、
十三咪啉[81412-43-3] + TX、嘧菌環胺[121552-61-2] + TX、嘧菌胺[110235-47-7]
+ TX、嘧黴胺 (pyrimethanil) [53112-28-0] + TX、拌種咯[74738-17-3] + TX、咯
菌腈 (fludioxonil) [131341-86-1] + TX、苯霜靈 (benalaxyl) [71626-11-4] + TX、
呋霜靈 (furalaxyl) [57646-30-7] + TX、甲霜靈[57837-19-1] + TX、R-甲霜靈
[70630-17-0] + TX、呋醯胺[58810-48-3] + TX、惡霜靈 (oxadixyl) [77732-09-3] +
TX、苯菌靈[17804-35-2] + TX、多菌靈[10605-21-7] + TX、咪菌威 (debacarb)
[62732-91-6] + TX、麥穗寧[3878-19-1] + TX、噻苯達唑[148-79-8] + TX、乙菌利
(chlozolate) [84332-86-5] + TX、菌核利 (dichlozoline) [24201-58-9] + TX、
異菌脲 (iprodione) [36734-19-7] + TX、myclozoline[54864-61-8] + TX、腐黴利
(procymidone) [32809-16-8] + TX、乙烯菌核利 (vinclozoline) [50471-44-8] +
TX、啞醯菌胺 (boscalid) [188425-85-6] + TX、菱鏽靈[5234-68-4] + TX、甲呋
醯苯胺[24691-80-3] + TX、氟醯胺 (flutolanil) [66332-96-5] + TX、滅鏽胺
[55814-41-0] + TX、氧化菱鏽靈[5259-88-1] + TX、吡噻菌胺 (penthioopyrad)
[183675-82-3] + TX、噻呋菌胺[130000-40-7] + TX、雙胍鹽[108173-90-6] + TX、

多果定 (dodine) [2439-10-3][112-65-2] (游離鹼) + TX、雙胍辛胺 (iminocadine) [13516-27-3] + TX、噁菌酯[131860-33-8] + TX、噁菌胺[149961-52-4] + TX、烯肱菌酯{Proc. BCPC,Int. Congr., Glasgow, 2003, 1, 93} + TX、氟噁菌酯 [361377-29-9] + TX、甲基噁菌酯[143390-89-0] + TX、苯氧菌胺[133408-50-1] + TX、肱菌酯[141517-21-7] + TX、肱噁菌胺[248593-16-0] + TX、啞氧菌酯 [117428-22-5] + TX、啞菌胺酯[175013-18-0] + TX、福美鐵[14484-64-1] + TX、代森錳鋅[8018-01-7] + TX、代森錳[12427-38-2] + TX、代森聯[9006-42-2] + TX、甲代森鋅(propineb) [12071-83-9] + TX、塞侖[137-26-8] + TX、代森鋅[12122-67-7] + TX、福美鋅[137-30-4] + TX、敵菌丹 (captafol) [2425-06-1] + TX、克菌丹 [133-06-2] + TX、苯氟磺胺[1085-98-9] + TX、啞啞草 (fluoroimide) [41205-21-4] + TX、滅菌丹[133-07-3] + TX、甲苯氟磺胺[731-27-1] + TX、波爾多混合劑 [8011-63-0] + TX、氫氧化銅 (copperhydroxid) [20427-59-2] + TX、氯化銅 (copperoxychlorid) [1332-40-7] + TX、硫酸銅 (coppersulfat) [7758-98-7] + TX、氧化銅(copperoxid) [1317-39-1] + TX、代森錳銅(mancopper) [53988-93-5] + TX、喹啉銅 (oxine-copper) [10380-28-6] + TX、敵蟎普 (dinocap) [131-72-6] + TX、噁菌酯 (nitrothal-isopropyl) [10552-74-6] + TX、克瘟散[17109-49-8] + TX、異稻瘟淨 (iprobenphos) [26087-47-8] + TX、稻瘟靈 (isoprothiolane) [50512-35-1] + TX、氯瘟磷 (phosdiphen) [36519-00-3] + TX、克菌磷 (pyrazophos) [13457-18-6] + TX、甲基托氯磷 (tolclofos-methyl) [57018-04-9] + TX、阿拉酸式苯-S-甲基 [135158-54-2] + TX、敵菌靈[101-05-3] + TX、苯噁菌胺[413615-35-7] + TX、滅瘟素 (blasticidin)-S[2079-00-7] + TX、滅蟎猛 (chinomethionat) [2439-01-2] + TX、地茂散 (chloroneb) [2675-77-6] + TX、百菌清[1897-45-6] + TX、環氟菌胺 [180409-60-3] + TX、霜脲氰[57966-95-7] + TX、二氯萘醌 (dichlone) [117-80-6] + TX、雙氯氰菌胺 (diclocymet) [139920-32-4] + TX、噁菌酮 (diclomezine)

[62865-36-5] + TX、氯硝胺 (dicloran) [99-30-9] + TX、乙黴威 (diethofencarb) [87130-20-9] + TX、烯醯味啉[110488-70-5] + TX、SYP-LI90 (Flumorph) [211867-47-9] + TX、二噻農 (dithianon) [3347-22-6] + TX、噻唑菌胺 (ethaboxam) [162650-77-3] + TX、土菌靈 (etridiazole) [2593-15-9] + TX、惡唑菌酮 [131807-57-3] + TX、咪唑菌酮 (fenamidone) [161326-34-7] + TX、稻瘟醯胺 (fenoxanil) [115852-48-7] + TX、三苯錫 (fentin) [668-34-8] + TX、嘧菌脞 (ferimzone) [89269-64-7] + TX、氟啶胺 (fluazinam) [79622-59-6] + TX、氟吡菌胺 (fluopicolide) [239110-15-7] + TX、磺菌胺 (flusulfamide) [106917-52-6] + TX、環醯菌胺 [126833-17-8] + TX、福賽得 (fosetyl-aluminium) [39148-24-8] + TX、惡黴靈 (hymexazol) [10004-44-1] + TX、丙森鋅 [140923-17-7] + TX、IKF-916 (賽座滅 (Cyazofamid)) [120116-88-3] + TX、春日黴素 (kasugamycin) [6980-18-3] + TX、磺菌威 (methasulfocarb) [66952-49-6] + TX、苯菌酮 [220899-03-6] + TX、戊菌隆 (pencycuron) [66063-05-6] + TX、苯酞 [27355-22-2] + TX、多氧黴素 (polyoxins) [11113-80-7] + TX、噻菌靈 (probenazole) [27605-76-1] + TX、百維威 (propamocarb) [25606-41-1] + TX、碘喹唑酮 (proquinazid) [189278-12-4] + TX、樂喹酮 (pyroquilon) [57369-32-1] + TX、喹氧靈 [124495-18-7] + TX、五氯硝苯 [82-68-8] + TX、硫 [7704-34-9] + TX、噻醯菌胺 [223580-51-6] + TX、咪唑吡 (triazoxide) [72459-58-6] + TX、三環唑 [41814-78-2] + TX、吡啶靈 (triforine) [26644-46-2] + TX、有效黴素 [37248-47-8] + TX、苯醯菌胺 (zoxamide) (RH7281) [156052-68-5] + TX、雙炔醯菌胺 (mandipropamid) [374726-62-2] + TX、吡蚜酮 (isopyrazam) [881685-58-1] + TX、塞德因 (sedaxane) [874967-67-6] + TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸(9-二氯亞甲基-1,2,3,4-四氫-1,4-甲橋-萘-5-基)-醯胺 (揭露於 WO 2007/048556 中) + TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸(3',4',5'-三氟-聯苯基-2-基)-醯胺 (揭露於 WO 2006/087343 中) + TX、

[(3*S*,4*R*,4*aR*,6*S*,6*aS*,12*R*,12*aS*,12*bS*)-3-[(環 丙 基 羧 基)氧
基]-1,3,4,4*a*,5,6,6*a*,12,12*a*,12*b*-十氫-6,12-二羥基-4,6*a*,12*b*-三甲基-11-側氧基-9-(3-
吡 啶 基)-2*H*,11*H*萘 并[2,1-*b*]哌 喃 并[3,4-*e*]哌 喃-4-基]甲 基-環 丙 甲 酸 酯
[915972-17-7] + TX以及1,3,5-三 甲 基-*N*-(2-甲 基-1-氧 丙 基)-*N*-[3-(2-甲 基 丙
基)-4-[2,2,2-三 氟-1-甲 氧 基-1-(三 氟 甲 基)乙 基]苯 基]-1*H*-吡 啶-4-甲 醯 胺
[926914-55-8] + TX ; lancotrione [1486617-21-3] + TX ; 氯 氟 吡 啶 酯 [943832-81-3]
+ TX ; 愛 分 三 氟 那 唑 (ipfentrifluconazole) [1417782-08-1] + TX ; mefentrifluconazole
[1417782-03-6] + TX ; quinofumelin [861647-84-9] + TX ; 右 旋 反 式 氯 丙 炔 菊 酯
[399572-87-3] + TX ; 氯 氟 氰 蟲 醯 胺 [1262605-53-7] + TX ; 三 氟 咪 啶 醯 胺
[1254304-22-7] + Tx ; fluxametamide [928783-29-3] + TX ; ϵ -甲 氧 苄 氟 菊 酯
[240494-71-7] + TX ; ϵ -momfluorothrin [1065124-65-3] + TX ; 氟 啶 菌 醯 脞 胺
(pydiflumetofen) [1228284-64-7] + TX ; κ -聯 苯 菊 酯 [439680-76-9] + TX ;
broflanilide [1207727-04-5] + TX ; dicloromezotiaz [1263629-39-5] + TX ;
dipymetitron [16114-35-5] + Tx ; pyraziflumid [942515-63-1] + TX ; κ -七 氟 菊 酯
[391634-71-2] + TX ; 苯 吡 克 咪 德 (fenpicoxamid) [517875-34-2] + TX ; 氟 茛 啶 菌
胺 (fluindapyr) [1383809-87-7] + TX ; α -溴 敵 隆 (alpha-bromadiolone) [28772-56-7]
+ TX ; flupyrimin [1689566-03-7] + TX ; 苯 皮 瑞 莫 散 (benzpyrimoxan)
[1449021-97-9] + TX ; acynonapyr [1332838-17-1] + TX ; 因 得 路 米 特 (inpyrfluxam)
[1352994-67-2] + Tx , isoflucypram [1255734-28-1] + TX ; 紅 圓 介 殼 蟲 引 誘 劑
(rescalure) [64309-03-1] + TX ; 胺 基 比 林 (aminopyrifen) [1531626-08-0] + TX ;
tyclopypyrazoflor [1477919-27-9] + TX ; 和 四 聚 酸 殺 蟲 劑 (spiropidion)
[1229023-00-0] + TX ; 以及

微生物劑，包括：魯氏不動桿菌+ TX、枝頂孢屬真菌+ TX + TX、頂頭孢黴
菌+ TX + TX、Acremonium diospyri+ TX、Acremonium obclavatum + TX、棉褐

帶卷蛾顆粒體病毒 (AdoxGV) (Capex®) + TX、放射形土壤桿菌菌株K84 (Galltrol-A®) + TX、鏈格孢菌+ TX、決明鏈格孢+ TX、損毀鏈格孢 (Alternaria destruens) (Smolder®) + TX、白粉寄生孢 (AQ10®) + TX、黃麴黴AF36 (AF36®) + TX、黃麴黴NRRL 21882 (Aflaguard®) + TX、麴黴屬物種+ TX、出芽短梗黴菌+ TX、固氮螺菌+ TX、(MicroAZ® + TX、TAZO B®) + TX、固氮菌+ TX、褐球固氮菌 (Azotobacter chroococcum) (Azotomeal®) + TX、固氮菌囊孢 (Bionatural Blooming Blossoms®) + TX、解澱粉芽孢桿菌+ TX、蠟樣芽孢桿菌+ TX、蝕幾丁質芽孢桿菌菌株 (Bacillus chitinosporus strain) CM-1 + TX、蝕幾丁質芽孢桿菌菌株 (Bacillus chitinosporus strain) AQ746 + TX、地衣芽孢桿菌菌株HB-2 (Biostart™ Rhizoboost®) + TX、地衣芽孢桿菌菌株3086 (EcoGuard® + TX、Green Releaf®) + TX、環狀芽孢桿菌+ TX、堅強芽孢桿菌 (BioSafe® + TX、BioNem-WP® + TX、VOTiVO®) + TX、堅強芽孢桿菌菌株I-1582 + TX、浸麻芽孢桿菌+ TX、死海芽孢桿菌 (Bacillus marismortui) + TX、巨大芽孢桿菌+ TX、蕈狀芽孢桿菌菌株AQ726 + TX、乳突芽孢桿菌 (Milky Spore Powder®) + TX、短小芽孢桿菌屬物種+ TX、短小芽孢桿菌菌株GB34 (Yield Shield®) + TX、短小芽孢桿菌菌株AQ717 + TX、短小芽孢桿菌菌株QST 2808 (Sonata® + TX、Ballad Plus®) + TX、球形芽孢桿菌 (Bacillus spahericus) (VectoLex®) + TX、芽孢桿菌屬物種+ TX、芽孢桿菌屬菌株AQ175 + TX、芽孢桿菌屬菌株AQ177 + TX、芽孢桿菌屬菌株AQ178 + TX、枯草芽孢桿菌菌株QST 713 (CEASE® + TX、Serenade® + TX、Rhapsody®) + TX、枯草芽孢桿菌菌株QST 714 (JAZZ®) + TX、枯草芽孢桿菌菌株AQ153 + TX、枯草芽孢桿菌菌株AQ743 + TX、枯草芽孢桿菌菌株QST3002 + TX、枯草芽孢桿菌菌株QST3004 + TX、解澱粉枯草芽孢桿菌變種菌株FZB24 (Taegro® + TX、Rhizopro®) + TX、蘇雲金芽孢桿菌Cry 2Ae + TX、蘇雲金芽孢桿菌Cry1Ab + TX、蘇雲金芽孢桿菌鱈澤 (Bacillus thuringiensis

aizawai) GC 91 (Agree®) + TX、蘇雲金芽孢桿菌以色列 (Bacillus thuringiensis israelensis) (BMP123® + TX、Aquabac® + TX、VectoBac®) + TX、蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克 (Bacillus thuringiensis kurstaki) (Javelin® + TX、Deliver® + TX、CryMax® + TX、Bonide® + TX、Scutella WP® + TX、Turilav WP® + TX、Astuto® + TX、Dipel WP® + TX、Biobit® + TX、Foray®) + TX、蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克 BMP 123 (Baritone®) + TX、蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克 HD-1 (Bioprotec-CAF / 3P®) + TX、蘇雲金芽孢桿菌菌株BD#32 + TX、蘇雲金芽孢桿菌菌株AQ52 + TX、蘇雲金芽孢桿菌鯰澤變種 (Bacillus thuringiensis var. aizawai) (XenTari® + TX、DiPel®) + TX、細菌屬物種 (bacteria spp.) (GROWMEND® + TX、GROWSWEET® + TX、Shootup®) + TX、Clavipacter michiganensis噬菌體 (AgriPhage®) + TX、Bakflor® + TX、球孢白僵菌 (Beauveria bassiana) (Beaugenic® + TX、Brocaril WP®) + TX、球孢白僵菌GHA (Mycotrol ES® + TX、Mycotrol O® + TX、BotaniGuard®) + TX、布氏白僵菌 (Beauveria brongniartii) (Engerlingspilz® + TX、Schweizer Beauveria® + TX、Melocont®) + TX、白僵菌屬物種 (Beauveria spp.) + TX、灰葡萄孢菌 (Botrytis cineria) + TX、大豆慢生型根瘤菌 (Bradyrhizobium japonicum) (TerraMax®) + TX、短短小芽孢桿菌 (Brevibacillus brevis) + TX、蘇雲金芽孢桿菌擬步行甲 (Bacillus thuringiensis tenebrionis) (Novodor®) + TX、BtBooster + TX、洋蔥伯克霍爾德菌 (Burkholderia cepacia) (Deny® + TX、Intercept® + TX、Blue Circle®) + TX、伯克霍爾德菌 (Burkholderia gladii) + TX、唐菖蒲伯克霍爾德菌 (Burkholderia gladioli) + TX、伯克霍爾德菌屬物種 (Burkholderia spp.) + TX、加拿大薊真菌 (Canadian thistle fungus) (CBH Canadian Bioherbicide®) + TX、乳酪假絲酵母 (Candida butyri) + TX、無名假絲酵母 (Candida famata) + TX、Candida fructus + TX、光滑念珠菌 (Candida glabrata) + TX、吉利蒙念珠菌 (Candida guilliermondii)

+ TX、口津假絲酵母 (*Candida melibiosica*) + TX、橄欖假絲酵母 (*Candida oleophila*) 菌株O + TX、近平滑假絲酵母 (*Candida parapsilosis*) + TX、菌膜假絲酵母 (*Candida pelliculosa*) + TX、鐵紅假絲酵母 (*Candida pulcherrima*) + TX、瑞氏假絲酵母 (*Candida reukaufii*) + TX、齊藤假絲酵母 (*Candida saitoana*) (Bio-Coat® + TX、Biocure®) + TX、清酒假絲酵母 (*Candida sake*) + TX、假絲酵母屬物種 (*Candida spp.*) + TX、纖細假絲酵母 (*Candida tenuis*) + TX、戴氏西地西菌 (*Cedecea dravisae*) + TX、產黃纖維單胞菌 (*Cellulomonas flavigena*) + TX、螺卷毛殼 (*Chaetomium cochliodes*) (Nova-Cide®) + TX、球毛殼菌 (*Chaetomium globosum*) (Nova-Cide®) + TX、鐵杉紫色桿菌 (*Chromobacterium subtsugae*) 菌株PRAA4-1T (Grandevo®) + TX、枝狀枝孢菌 (*Cladosporium cladosporioides*) + TX、尖孢枝孢 (*Cladosporium oxysporum*) + TX、綠頭枝孢 (*Cladosporium chlorocephalum*) + TX、枝孢屬物種 (*Cladosporium spp.*) + TX、極細枝孢黴 (*Cladosporium tenuissimum*) + TX、粉紅黏帚黴 (*Clonostachys rosea*) (EndoFine®) + TX、尖孢炭疽菌 (*Colletotrichum acutatum*) + TX、盾殼黴 (*Coniothyrium minitans*) (Cotans WG®) + TX、盾殼黴屬物種 (*Coniothyrium spp.*) + TX、淺白隱球酵母 (*Cryptococcus albidus*) (YIELDPLUS®) + TX、土生隱球菌 (*Cryptococcus humicola*) + TX、隱球酵母屬 *infirmitus* + TX、羅倫隱球酵母 (*Cryptococcus laurentii*) + TX、蘋果異形小卷蛾顆粒體病毒 (*Cryptophlebia leucotreta granulovirus*) (Cryptex®) + TX、*Cupriavidus campinensis* + TX、蘋果蠹蛾顆粒體病毒 (*Cydia pomonella granulovirus*) (CYD-X®) + TX、蘋果蠹蛾顆粒體病毒 (Madex® + TX、Madex Plus® + TX、Madex Max/ Carpovirusine®) + TX、*Cylindrobasidium laeve* (Stumpout®) + TX、枝雙孢黴屬 (*Cylindrocladium*) + TX、漢遜德巴厘酵母 (*Debaryomyces hansenii*) + TX、*Drechslera hawaiiensis* + TX、陰溝腸桿菌 (*Enterobacter cloacae*) + TX、

腸桿菌科(Enterobacteriaceae)+ TX、毒力蟲黴(Entomophthora virulenta)(Vektor®)
+ TX、附球菌(Epicoccum nigrum)+ TX、黑附球菌(Epicoccum purpurascens)
+ TX、附球孢屬物種+ TX、Filobasidium floriforme+ TX、銳頂鏢孢菌+ TX、厚
孢鏢刀菌+ TX、尖孢鏢刀菌(Fusaclean®/Biofox C®)+ TX、層出鏢刀菌+ TX、
鏢刀菌屬物種+ TX、白地黴(Galactomyces geotrichum)+ TX、鏈孢黏帚黴
(Gliocladium catenulatum)(Primastop®+ TX、Prestop®)+ TX、粉紅黏帚黴
(Gliocladium roseum)+ TX、黏帚黴屬物種(SoilGard®)+ TX、綠黏帚黴
(Soilgard®)+ TX、顆粒體病毒(Granupom®)+ TX、嗜鹽鹽芽孢桿菌
(Halobacillus halophilus)+ TX、岸喜鹽芽孢桿菌(Halobacillus litoralis)+ TX、
特氏鹽芽孢桿菌(Halobacillus trueperi)+ TX、鹽單胞菌屬物種+ TX、冰下鹽單
胞菌(Halomonas subglaciescola)+ TX、多變鹽弧菌(Halovibrio variabilis)+ TX、
葡萄汁有孢漢遜酵母+ TX、棉鈴蟲核型多角體病毒(Helicovex®)+ TX、穀實
夜蛾核型多角體病毒(Gemstar®)+ TX、異黃酮-芒柄花黃素(Myconate®)+ TX、
檸檬克勒克酵母+ TX、克勒克酵母屬物種+ TX、大鏈壺菌(Lagenidium
giganteum)(Laginex®)+ TX、長孢蠟蚧菌(Lecanicillium longisporum)
(Vertiblast®)+ TX、蠟蚧疥黴(Lecanicillium muscarium)(Vertikil®)+ TX、
舞毒蛾核型多角體病毒(Disparvirus®)+ TX、嗜鹽海球菌+ TX、格氏梅拉菌
(Meira geulakonigii)+ TX、綠僵菌(Met52®)+ TX、綠僵菌(Destruxin WP®)
+ TX、Metschnikowia fruticola(Shemer®)+ TX、美極梅奇酵母(Metschnikowia
pulcherrima)+ TX、Microdochium dimerum(Antibot®)+ TX、天藍色小單孢菌
(Micromonospora coerulea)+ TX、Microsphaeropsis ochracea+ TX、惡臭白色
真菌(Muscodor albus) 620(Muscudor®)+ TX、Muscodor roseus菌株A3-5+ TX、
菌根屬物種(Mycorrhizae spp.)(AMykor®+ TX、Root Maximizer®)+ TX、
疣孢漆斑菌菌株AARC-0255(DiTera®)+ TX、BROS PLUS®+ TX、Ophiostoma

piliferum 菌株 D97 (Sylvanex®) + TX、粉質擬青黴 (Paecilomyces farinosus) + TX、
 玫瑰煙色擬青黴 (PFR-97® + TX、PreFeRal®) + TX、淡紫擬青黴 (Paecilomyces
 lilacinus) (Biostat WP®) + TX、淡紫擬青黴菌株 251 (MeloCon WG®) + TX、
 多黏類芽孢桿菌 + TX、成團泛菌 (BlightBan C9-1®) + TX、泛菌屬物種 + TX、
 巴斯德氏芽菌屬物種 (Econem®) + TX、擬斯紮瓦巴氏桿菌 (Pasteuria nishizawae)
 + TX、黃灰青黴 + TX、拜賴青黴 (Penicillium billai) (Jumpstart® + TX、TagTeam®)
 + TX、短密青黴 + TX、常現青黴 + TX、灰黃青黴 + TX、產紫青黴 + TX、青黴菌
 屬物種 + TX、純綠色青黴 + TX、大伏革菌 (Phlebiopsis gigantea) (Rotstop®)
 + TX、解磷細菌 (Phosphomeal®) + TX、隱地疫黴 + TX、棕櫚疫黴 (Devine®)
 + TX、異常畢赤酵母 + TX、季也蒙畢赤酵母 (Pichia guilhermondii) + TX、膜醭
 畢赤氏酵母 + TX、指甲畢赤酵母 + TX、樹幹畢赤酵母 + TX、銅綠假單胞菌 + TX、
 致金色假單胞菌 (Pseudomonas aureofasciens) (Spot-Less Biofungicide®) + TX、
 洋蔥假單胞菌 + TX、綠針假單胞菌 (AtEze®) + TX、皺褶假單胞菌 (Pseudomonas
 corrugate) + TX、螢光假單胞菌菌株 A506 (BlightBan A506®) + TX、惡臭假單
 胞菌 + TX、Pseudomonas reactans + TX、假單胞菌屬物種 + TX、丁香假單胞菌
 (Bio-Save®) + TX、綠黃假單胞菌 + TX、螢光假單胞菌 (Zequanox®) + TX、
 Pseudozyma flocculosa 菌株 PF-A22 UL (Sporodex L®) + TX、縱溝柄鏽菌 (Puccinia
 canaliculata) + TX、Puccinia thlaspeos (Wood Warrior®) + TX、側雄腐黴菌 (Pythium
 oligandrum) + TX、寡雄腐黴 (Polygandron® + TX、Polyversum®) + TX、纏器
 腐黴 + TX、水生拉恩菌 (Rhanella aquatilis) + TX、拉恩菌屬物種 (Rhanella spp.)
 + TX、根瘤菌 (Rhizobia) (Dormal® + TX、Vault®) + TX、絲核菌 (Rhizoctonia)
 + TX、球狀紅球菌 (Rhodococcus globerulus) 菌株 AQ719 + TX、雙倒卵形紅冬
 孢酵母菌 (Rhodosporidium diobovatum) + TX、圓紅冬孢酵母菌 (Rhodosporidium
 toruloides) + TX、紅酵母屬物種 (Rhodotorula spp.) + TX、黏紅酵母 (Rhodotorula

glutinis)+ TX、禾本紅酵母(Rhodotorula graminis)+ TX、膠紅酵母(Rhodotorula mucilagnosa)+ TX、深紅酵母(Rhodotorula rubra)+ TX、釀酒酵母(Saccharomyces cerevisiae)+ TX、玫瑰色鹽水球菌(Salinococcus roseus)+ TX、小核盤菌(Sclerotinia minor)+ TX、小核盤菌(SARRITOR®)+ TX、柱頂孢黴屬物種(Scybalidium spp.)+ TX、Scybalidium uredinicola+ TX、甜菜夜蛾核型多角體病毒(Spodoptera exigua nuclear polyhedrosis virus)(Spod-X®+ TX、Spexit®)+ TX、黏質沙雷氏菌(Serratia marcescens)+ TX、普城沙雷菌(Serratia plymuthica)+ TX、沙雷氏菌屬物種(Serratia spp.)+TX、糞生糞殼菌(Sordaria fimicola)+ TX、海灰翅夜蛾核型多角體病毒(Spodoptera littoralis nucleopolyhedrovirus)(Littovir®)+ TX、紅擲孢酵母(Sporobolomyces roseus)+ TX、嗜麥芽寡養單胞菌(Stenotrophomonas maltophilia)+ TX、不吸水鏈黴菌(Streptomyces ahygroscopicus)+ TX、白丘鏈黴菌(Streptomyces albaduncus)+ TX、脫葉鏈黴菌(Streptomyces exfoliates)+ TX、鮮黃鏈黴菌(Streptomyces galbus)+ TX、灰平鏈黴菌(Streptomyces griseoplanus)+ TX、灰綠鏈黴菌(Streptomyces griseoviridis)(Mycostop®)+ TX、利迪鏈黴菌(Streptomyces lydicus)(Actinovate®)+ TX、利迪鏈黴菌WYEC-108(ActinoGrow®)+ TX、紫色鏈黴菌(Streptomyces violaceus)+ TX、小鐵艾酵母(Tilletiopsis minor)+ TX、鐵艾酵母屬物種(Tilletiopsis spp.)+ TX、棘孢木黴(Trichoderma asperellum)(T34 Biocontrol®)+ TX、蓋姆斯木黴(Trichoderma gamsii)(Tenet®)+ TX、深綠木黴(Trichoderma atroviride)(Plantmate®)+ TX、鉤狀木黴(Trichoderma hamatum) TH 382+ TX、哈茨木黴(Trichoderma harzianum rifai)(Mycostar®)+ TX、哈茨木黴(Trichoderma harzianum) T-22(Trianum-P®+ TX、PlantShield HC®+ TX、RootShield®+ TX、Trianum-G®)+ TX、哈茨木黴(Trichoderma harzianum) T-39(Trichodex®)+ TX、非鉤木黴(Trichoderma inhamatum)+ TX、康寧木黴

(*Trichoderma koningii*) + TX、木黴屬物種 (*Trichoderma* spp.) LC 52 (Sentinel®) + TX、木素木黴 (*Trichoderma lignorum*) + TX、長柄木黴 (*Trichoderma longibrachiatum*) + TX、多孢木黴 (*Trichoderma polysporum*) (Binab T®) + TX、紫杉木黴 (*Trichoderma taxi*) + TX、綠色木黴 (*Trichoderma virens*) + TX、綠色木黴 (原來稱為綠色黏帚黴 (*Gliocladium virens*) GL-21) (SoilGuard®) + TX、綠色木黴 (*Trichoderma viride*) + TX、綠色木黴菌株 ICC 080 (Remedier®) + TX、茁芽絲孢酵母 (*Trichosporon pullulans*) + TX、毛孢子菌屬物種 (*Trichosporon* spp.) + TX、單端孢屬物種 (*Trichothecium* spp.) + TX、粉紅單端孢 (*Trichothecium roseum*) + TX、*Typhula phacorrhiza* 菌株 94670 + TX、*Typhula phacorrhiza* 菌株 94671 + TX、黑細基格孢 (*Ulocladium atrum*) + TX、奧德曼細基格孢 (*Ulocladium oudemansii*) (Botry-Zen®) + TX、玉蜀黍黑粉菌 (*Ustilago maydis*) + TX、各種細菌和補充微量營養素 (Natural II®) + TX、各種真菌 (Millennium Microbes®) + TX、厚垣輪枝孢菌 (*Verticillium chlamyosporium*) + TX、蠟蚧輪枝菌 (*Verticillium lecanii*) (Mycotal® + TX、Vertalec®) + TX、Vip3Aa20 (VIPtera®) + TX、死海枝芽孢桿菌 (*Virgibacillus marismortui*) + TX、野油菜黃單胞菌 pv. *Poa* (Camperico®) + TX、伯氏致病桿菌 + TX、嗜線蟲致病桿菌；以及

植物提取物，包括：松樹油 (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、土荊芥 (*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、甜菜鹼 (Greenstim®) + TX、大蒜 + TX、檸檬草油 (GreenMatch®) + TX、印楝油 + TX、貓薄荷 (*Nepeta cataria*) (貓薄荷油) + TX、*Nepeta catarina* + TX、菸鹼 + TX、

牛至油 (MossBuster®) + TX、胡麻科 (Pedaliaceae) 油 (Nematon®) + TX、除蟲菊+ TX、皂皮樹 (*Quillaja saponaria*) (NemaQ®) + TX、大虎杖 (*Reynoutria sachalinensis*) (Regalia®+ TX、Sakalia®) + TX、魚藤酮 (Eco Roten®) + TX、芸香科 (Rutaceae) 植物提取物 (Soleo®) + TX、大豆油 (Ortho ecosense®) + TX、茶樹油 (Timorex Gold®) + TX、百里香油+ TX、AGNIQUE® MMF+ TX、BugOil®+ TX、迷迭香-芝麻-胡椒薄荷-百里香和肉桂提取物混合物 (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、高嶺土 (Screen®) + TX、褐藻的貯存葡聚糖 (Laminarin®)；以及

資訊素，包括：黑頭螢火蟲資訊素 (3M Sprayable Blackheaded Fireworm Pheromone®) + TX、蘋果蠹蛾資訊素 (Paramount dispenser-(CM)/ Isomate C-Plus®) + TX、葡萄小卷葉蛾信息素 (3M MEC-GBM Sprayable Pheromone®) + TX、卷葉蟲信息素 (3M MEC – LR Sprayable Pheromone®) + TX、家蠅信息素 (Muscamone) (Snip7 Fly Bait® + TX、Starbar Premium Fly Bait®) + TX、梨小食心蟲信息素 (3M oriental fruit moth sprayable pheromone®) + TX、桃透翅蛾 (Peachtree Borer) 信息素 (Isomate-P®) + TX、番茄蟻蟲 (Tomato Pinworm) 信息素 (3M Sprayable pheromone®) + TX、衣透斯特粉末 (Entostat powder) (來自棕櫚樹的提取物) (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、乙酸鈣+ TX、Scenturion® + TX、Biolure® + TX、Check-Mate® + TX、薰衣草千里酸酯 (Lavandulyl senecioate)；以及

宏生物劑 (Macrobial)，包括：短距蚜小蜂 + TX、阿爾蚜繭蜂 (*Aphidius ervi*) (Aphelinus-System®) + TX、*Acerophagus papaya* + TX、二星瓢蟲

(Adalia-System®) + TX、二星瓢蟲 (Adaline®) + TX、二星瓢蟲 (Aphidalia®) + TX、串繭跳小蜂 (*Ageniaspis citricola*) + TX、巢蛾多胚跳小蜂 + TX、安德森鈍綏蟎 (*Amblyseius andersoni*) (Anderline® + TX、Andersoni-System®) + TX、加州鈍綏蟎 (*Amblyseius californicus*) (Amblyline® + TX、Spical®) + TX、黃瓜鈍綏蟎 (Thripex® + TX、Bugline cucumeris®) + TX、偽鈍綏蟎 (Fallacis®) + TX、斯氏鈍綏蟎 (Bugline swirskii® + TX、Swirskii-Mite®) + TX、奧氏鈍綏蟎 (WomerMite®) + TX、粉虱細蜂 (*Amitus hesperidum*) + TX、原櫻翅繭小蜂 (*Anagrus atomus*) + TX、暗腹長索跳小蜂 (*Anagrus fusciventris*) + TX、卡瑪長索跳小蜂 (*Anagrus kamali*) + TX、*Anagrus loeckii* + TX、粉蚧長索跳小蜂 (*Anagrus pseudococci*)(Citripar®) + TX、紅蠟蚧扁角跳小蜂 (*Anicetus benefices*) + TX、金小蜂 (*Anisopteromalus calandrae*) + TX、林地花蝽 (*Anthocoris nemoralis*) (Anthocoris-System®) + TX、短距蚜小蜂 (Apheline® + TX、Aphiline®) + TX、短翅蚜小蜂 (*Aphelinus asychis*) + TX、棉蚜寄生蜂 (*Aphidius colemani*)(Aphipar®) + TX、阿爾蚜繭蜂 (Ervipar®) + TX、煙蚜繭蜂 + TX、桃赤蚜蚜繭蜂 (Aphipar-M®) + TX、食蚜癭蚊 (Aphidend®) + TX、食蚜癭蚊 (Aphidoline®) + TX、嶺南黃蚜小蜂 + TX、印巴黃蚜小蜂 + TX、哈氏長尾齧小蜂 (*Aprostocetus hagenowii*) + TX、蟻形隱翅甲 (*Atheta coriaria*) (Staphyline®) + TX、熊蜂屬物種 + TX、歐洲熊蜂 (Natupol Beehive®) + TX、歐洲熊蜂 (Beeline® + TX、Tripol®) + TX、*Cephalonomia stephanoderis* + TX、黑背唇瓢蟲 (*Chilocorus nigritus*) + TX、普通草蛉 (*Chrysoperla carnea*) (Chrysoline®) + TX、普通草蛉 (Chrysopa®) + TX、紅通草蛉 (*Chrysoperla rufilabris*) + TX、*Cirrospilus ingenuus* + TX、四帶瑟姬小蜂 (*Cirrospilus quadristriatus*) + TX、白星橘齧小蜂 (*Citrostichus phyllocnistoides*) + TX、*Closterocerus chamaeleon* + TX、*Closterocerus*屬物種 + TX、*Coccidoxenoides perminutus* (Planopar®) + TX、泊蚜小蜂 (*Coccophagus*

cowperi) + TX、賴食蚧蚜小蜂 (*Coccophagus lycimnia*) + TX、螟黃足盤絨繭蜂 + TX、菜蛾絨繭蜂 + TX、孟氏隱唇瓢蟲 (Cryptobug® + TX、Cryptoline®) + TX、日本方頭甲 + TX、西伯利亞離顎繭蜂 + TX、西伯利亞離顎繭蜂 (Minusa®) + TX、豌豆潛葉蠅姬小蜂 (Diminex®) + TX、小黑瓢蟲 (*Delphastus catalinae*) (Delphastus®) + TX、*Delphastus pusillus* + TX、*Diachasmimorpha krausii* + TX、長尾潛蠅繭蜂 + TX、*Diaparsis jucunda* + TX、阿裡食虱跳小蜂 (*Diaphorencyrtus aligarhensis*) + TX、豌豆潛葉蠅姬小蜂 + TX、豌豆潛葉蠅姬小蜂 (Miglyphus® + TX、Digline®) + TX、西伯利亞離顎繭蜂 (DacDigline® + TX、Minex®) + TX、歧脈跳小蜂屬物種 + TX、盾蚧長纓蚜小蜂 + TX、麗蚜小蜂 (*Encarsia max*® + TX、Encarline® + TX、En-Strip®) + TX、槳角蚜小蜂 (*Eretmocerus eremicus*) (Enermix®) + TX、哥德恩蚜小蜂 (*Encarsia guadeloupeae*) + TX、海地恩蚜小蜂 (*Encarsia haitiensis*) + TX、細餛飩蚜蠅 (Syrphidend®) + TX、*Eretmoceris siphonini* + TX、加州槳角蚜小蜂 (*Eretmocerus californicus*) + TX、槳角蚜小蜂 (*Eretmocerus eremicus*) (Ercal® + TX、Eretline e®) + TX、槳角蚜小蜂 (*Eretmocerus eremicus*) (Bemimix®) + TX、海氏槳角蚜小蜂 + TX、蒙氏槳角蚜小蜂 (Bemipar® + TX、Eretline m®) + TX、*Eretmocerus siphonini* + TX、四斑光緣瓢蟲 (*Exochomus quadripustulatus*) + TX、食蟎癭蚊 (*Feltiella acarisuga*) (Spidend®) + TX、食蟎癭蚊 (Feltiline®) + TX、阿里山潛蠅繭蜂 + TX、*Fopius ceratitivorus* + TX、芒柄花黃素 (Wirless Beehome®) + TX、細腰凶薊馬 (Vespop®) + TX、西方靜走蟎 (*Galendromus occidentalis*) + TX、萊氏棱角腫腿蜂 (*Goniozus legneri*) + TX、麥蛾柔繭蜂 + TX、異色瓢蟲 (HarmoBeetle®) + TX、異小桿線蟲屬物種 (Lawn Patrol®) + TX、嗜菌異小桿線蟲 (NemaShield HB® + TX、Nemaseek® + TX、Terranem-Nam® + TX、Terranem® + TX、Larvanem® + TX、B-Green® + TX、NemAttack ® + TX、Nematop®) + TX、大異小桿線蟲

(*Heterorhabditis megidis*)(Nemasys H® + TX、BioNem H® + TX、Exhibitline hm® + TX、Larvanem-M®) + TX、斑長足瓢蟲 (*Hippodamia convergens*) + TX、尖狹下盾蟻 (*Hypoaspis aculeifer*) (Aculeifer-System® + TX、Entomite-A®) + TX、兵下盾蟻 (*Hypoaspis miles*) (Hypoline m® + TX、Entomite-M®) + TX、黑色枝跗癭蜂 + TX、*Lecanoideus floccissimus* + TX、*Lemophagus errabundus* + TX、三色麗突跳小蜂(*Leptomastidea abnormis*) + TX、橘粉介殼蟲寄生蜂(*Leptomastix dactylopii*) (Leptopar®) + TX、長角跳小蜂 (*Leptomastix epona*) + TX、*Lindorus lophanthae* + TX、*Lipolexis oregmae* + TX、叉葉綠蠅 (Natuflly®) + TX、茶足柄瘤蚜繭蜂 + TX、盲蝽 (*Macrolophus caliginosus*) (Mirical-N® + TX、Macroline c® + TX、Mirical®) + TX、*Mesoseiulus longipes* + TX、黃色闊柄跳小蜂 (*Metaphycus flavus*) + TX、*Metaphycus lounsburyi* + TX、角紋脈褐蛉 (Milacewing®) + TX、黃色花翅跳小蜂 (*Microterys flavus*) + TX、*Muscidifurax raptorellus*和*Spalangia cameroni* (Biopar®) + TX、*Neodryinus typhlocybae* + TX、加州新小綏蟻 + TX、黃瓜新小綏蟻 (THRYPEX®) + TX、偽新小綏蟻 (*Neoseiulus fallacis*) + TX、*Nesideocoris tenuis* (NesidioBug® + TX、Nesibug®) + TX、古銅黑蠅 (Biofly®) + TX、狡小花蝽 (*Orius insidiosus*) (Thripor-I® + TX、Oriline i®) + TX、無毛小花蝽 (*Orius laevigatus*) (Thripor-L® + TX、Oriline l®) + TX、大臀小花蝽 (*Orius majusculus*) (Oriline m®) + TX、小黑花椿象 (Thripor-S®) + TX、*Pauesia juniperorum* + TX、瓢蟲柄腹姬小蜂 (*Pediobius foveolatus*) + TX、*Phasmarhabditis hermaphrodita* (Nemaslug®) + TX、*Phymastichus coffea* + TX、粗毛小植綏蟻 (*Phytoseiulus macropilus*) + TX、智利小植綏蟻 (Spidex® + TX、Phytoline p®) + TX、斑腹刺益蝽 (Podisus®) + TX、寄生性蚤蠅 (*Pseudacteon curvatus* + TX、寄生性蚤蠅 (*Pseudacteon obtusus* + TX、寄生性蚤蠅 (*Pseudacteon tricuspis*) + TX、*Pseudaphycus maculipennis* + TX、*Pseudleptomastix*

mexicana + TX、具毛嗜木虱跳小蜂 (*Psyllaephagus pilosus*) + TX、同色短背繭蜂 (*Psytalia concolor*) (複合物) + TX、胯姬小蜂屬物種 (*Quadrastichus* spp.) + TX、*Rhyzobius lophanthae* + TX、澳洲瓢蟲 + TX、*Rumina decollate* + TX、*Semielacher petiolatus* + TX、麥長管蚜 (Ervibank®) + TX、小卷蛾斯氏線蟲 (Nematac C® + TX、Millenium® + TX、BioNem C® + TX、NemAttack® + TX、Nemastar® + TX、Capsanem®) + TX、夜蛾斯氏線蟲 (NemaShield® + TX、Nemasys F® + TX、BioNem F® + TX、Steinernema-System® + TX、NemAttack® + TX、Nemaplus® + TX、Exhibitline sf® + TX、Scia-rid® + TX、Entonem®) + TX、鋸蜂線蟲 (*Steinernema kraussei*) (Nemasys L® + TX、BioNem L® + TX、Exhibitline srb®) + TX、銳比斯氏線蟲 (*Steinernema riobrave*) (BioVector® + TX、BioVektor®) + TX、螻蛄斯氏線蟲 (*Steinernema scapterisci*) (Nematac S®) + TX、斯氏線蟲屬物種 + TX、斯氏科 (*Steinernematid*) 屬物種 (Guardian Nematodes®) + TX、深點食蟻瓢蟲 (Stethorus®) + TX、亮腹絨小蜂 + TX、*Tetrastichus setifer* + TX、*Thripobius semiluteus* + TX、中華長尾小蜂 (*Torymus sinensis*) + TX、甘藍夜蛾赤眼蜂 (Tricholine b®) + TX、甘藍夜蛾赤眼蜂 (Tricho-Strip®) + TX、廣赤眼蜂 + TX、微小赤眼蜂 + TX、玉米螟赤眼蜂 + TX、寬脈赤眼蜂 (*Trichogramma platneri*) + TX、短管赤眼蜂 + TX、螟黑點瘤姬蜂 (*Xanthopimpla stemmator*) ; 以及

其他生物製劑，包括：脫落酸 + TX、bioSea® + TX、銀葉菌 (*Chondrostereum purpureum*) (Chontrol Paste®) + TX、盤長孢狀刺盤孢 (Collego®) + TX、辛酸銅 (Cueva®) + TX、 δ 捕捉物 (Delta trap) (Trapline d®) + TX、解澱粉歐文氏菌 (Harpin) (ProAct® + TX、Ni-HIBIT Gold CST®) + TX、磷酸高鐵 (Ferramol®) + TX、漏斗捕捉物 (Funnel trap) (Trapline y®) + TX、Gallex® + TX、Grower's Secret® + TX、高油菜素內酯 (Homo-brassonolide) + TX、磷酸鐵 (Lilly Miller

Worry Free Ferramol Slug & Snail Bait®) + TX、MCP冰雹捕捉物 (hail trap) (Trapline f®) + TX、寄生性昆蟲南美食甲繭蜂 (*Microctonus hyperodae*) + TX、*Mycoleptodiscus terrestris* (Des-X®) + TX、BioGain® + TX、Aminomite® + TX、Zenox® + TX、信息素羅網 (Thripline ams®) + TX、碳酸氫鉀 (MilStop®) + TX、脂肪酸的鉀鹽 (Sanova®) + TX、矽酸鉀溶液 (Sil-Matrix®) + TX、碘化鉀 + 硫氰酸鉀 (Enzicur®) + TX、SuffOil-X® + TX、蜘蛛毒 + TX、蝗蟲微孢子蟲 (Semaspore Organic Grasshopper Control®) + TX、黏捕捉物 (Trapline YF® + TX、Rebell Amarillo®) + TX以及捕捉物 (Takitrapline y + b®) + TX；

或選自以下的生物活性化合物或試劑：溴氟菊酯 + TX、氟蟎吡 (Diflovidazine) + TX、Flometoquin + TX、Fluhexafon + TX、小菜蛾顆粒體病毒 + TX、蘋果蠹蛾顆粒體病毒 + TX、新菸磷 (Imicyafos) + TX、菸芽夜蛾核多角體病毒 + TX、*Heliothis punctigera*核多角體病毒 + TX、玉米穗夜蛾核多角體病毒 + TX、草地貪夜蛾核多角體病毒 + TX、小菜蛾核多角體病毒 + TX、對傘花煙 + TX、Pyflubumide + TX、Pyrafluprole + TX、QRD 420 + TX、QRD 452 + TX、QRD 460 + TX、萜類混合物 + TX、萜類 + TX、氟氰蟲醯胺 (Tetraniliprole) + TX和 α -萜品烯 + TX

或由如下代碼 + TX提及的活性物質：代碼AE 1887196 (BSC-BX60309) + TX、代碼NNI-0745 GR + TX、代碼IKI-3106 + TX、代碼JT-L001 + TX、代碼ZNQ-08056 + TX、代碼IPPA152201 + TX、代碼HNPC-A9908 (CAS : [660411-21-2]) + TX、代碼HNPC-A2005 (CAS : [860028-12-2]) + TX、代碼JS118 + TX、代碼ZJ0967 + TX、代碼ZJ2242 + TX、代碼JS7119 (CAS : [929545-74-4]) + TX、代碼SN-1172 + TX、代碼HNPC-A9835 + TX、代碼HNPC-A9955 + TX、代碼HNPC-A3061 + TX、代碼Chuanhua 89-1 + TX、代碼IPP-10 + TX、代碼ZJ3265 + TX、代碼JS9117 + TX、代碼ZJ3757 + TX、代碼ZJ4042 + TX、代碼ZJ4014 + TX、

代碼ITM-121 + TX、代碼DPX-RAB55 (DKI-2301) + TX、代碼NA-89 + TX、代碼MIE-1209 + TX、代碼MCI-8007 + TX、代碼BCS-CL73507 + TX、代碼S-1871 + TX、代碼DPX-RDS63 + TX、Quinofumelin + TX、mefentrifluconazol + TX、氟皮噻米德 (fenpicoxamid) + TX、扶因達比 (fluindapyr) + TX、因得路米特 (inpyrfluxam) + TX或indiflumetpyr + TX、isoflucypram + TX、pyrapropoyne + TX、扶樂皮米德(florylpicoxamid) + TX、米特川坡(metyltetraprole) + TX、伊氟吩萘琴(ipflufenquin) + TX、pyridachlometyl + TX或chlopyridiflu + TX、四氯蟲醯胺 (tetrachlorantraniliprole) + TX、四氯安尼坡萊(tetrachloraniliprole) + TX、Tyclopyrazoflor + TX、flupyrimin + TX或pyrifluramide + TX、苯皮瑞莫安 (benzpyrimoxan) + TX、Benzosufyl + TX或oxazosulfyl + TX、乙唑蟎腈 (etpyrafen) + TX、acynonapyr + TX或pyrinonafen + TX、側氧基三酮 (oxotrione) + TX、bixlozone + TX或clofendizone + TX或二氯西從(dicloroxizone) + TX、cyclopyranil + TX或四螺皮瑞尼 (pyrazocyclonil) + TX或環皮瑞萘 (cyclopyrazonil) + TX、 α -溴敵隆 + TX、code AKD-1193 + TX、惡賽皮啉 (Oxathiapiprolin) + TX、氟吡菌醯胺 + TX、戊苯吡菌胺 + TX、扶皮賽得 (Fluoxopyrosad) + TX、以及氟吡呋喃酮 (Flupyradifurone) + TX。

【0348】 在活性成分之後的括弧中的參考，例如[3878-19-1]係指化學文摘登記號。上文描述的混合配伍物係已知的。當活性成分包括在「The Pesticide Manual [殺有害生物劑手冊]」The Pesticide Manual - A World Compendium [殺有害生物劑手冊-全球概覽]；第13版；編輯：C.D. S. Tomlin；The British Crop Protection Coimcil [英國農作物保護委員會]中，它們在其中以上文的特定化合物的圓括號中所給出的編號來描述；例如化合物「阿巴美丁」以編號(1)來描述。其中「[CCN]」係對於上文的特定化合物來加上的，所述的化合物包括在「Compendium of Pesticide Common Names[殺有害生物通用名概要]」中，其可

以在互聯網[A. Wood ; Compendium of Pesticide Common Names , Copyright (c) 1995-2004]上獲得；例如，化合物「乙醯蟲睛」描述於互聯網地址 <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>中。

【0349】 多數活性成分藉由上文中所謂的「通用名」來表示，在不同的情形中使用相應的「ISO通用名」或其它「通用名」。若其名稱不是「通用名」，則所使用的名稱種類以特定化合物的圓括號中所給出的名稱來代替；在該情形下，使用IUPAC名、IUPAC/化學文摘名、「化學名稱」、「慣用名」、「化合物名稱」或「發展代碼」，或若既不使用那些名稱之一也不使用「通用名」，則使用「別名」。「CAS登記號」意指化學文摘登記號。

【0350】 選自表A-1至A-17和表P的式I的化合物與上面描述的活性成分的活性成分混合物包含選自表A-1至A-17和表P的化合物以及如上所描述的活性成分，其混合比率較佳的是係從100 : 1至1 : 6000，尤其是從50 : 1至1 : 50，更尤其是從20 : 1至1 : 20的比率，甚至更尤其是從10 : 1至1 : 10，非常尤其是從5 : 1和1 : 5，特別較佳的是給出的是從2 : 1至1 : 2的比率，並且同樣較佳的是從4 : 1至2 : 1的比率，尤其是1 : 1、或5 : 1、或5 : 2、或5 : 3、或5 : 4、或4 : 1、或4 : 2、或4 : 3、或3 : 1、或3 : 2、或2 : 1、或1 : 5、或2 : 5、或3 : 5、或4 : 5、或1 : 4、或2 : 4、或3 : 4、或1 : 3、或2 : 3、或1 : 2、或1 : 600、或1 : 300、或1 : 150、或1 : 35、或2 : 35、或4 : 35、或1 : 75、或2 : 75、或4 : 75、或1 : 6000、或1 : 3000、或1 : 1500、或1 : 350、或2 : 350、或4 : 350、或1 : 750、或2 : 750、或4 : 750的比率。該等混合比率係按重量計的。

【0351】 如上所描述的混合物可以用在用於防治有害生物的方法中，該方法包括將包含如上所描述的混合物的組成物施用於有害生物或其環境中，而用於藉由手術或療法處理人體或動物體的方法以及在人體或動物體上實施的診斷方法除外。

【0352】 包含選自表A-1至A-17和表P的式I的化合物和如上所描述的一種或多種活性成分的混合物可以例如按以下來施用：以單一「即混即用物」的形式、以由單一活性成分組分的單獨配製物構成的組合噴霧混合物（諸如「桶混物」）、以及以在按順序方式（即以合理的短時間段（諸如幾小時或幾天）一個接一個地）施用的情況下組合使用該等單一活性成分。選自表A-1至A-17和表P的式I的化合物和如上所描述的活性成分的施用順序對於實施本發明不是至關重要的。

【0353】 根據本發明的組成物還可以包含另外的固體助劑或液體助劑，諸如穩定劑，例如未環氧化的或環氧化的植物油（例如環氧化的椰子油、菜籽油或大豆油），消泡劑（例如矽油），防腐劑，黏度調節劑，黏合劑和/或增黏劑，肥料或用於獲得特定效果的其他活性成分，例如殺細菌劑、殺真菌劑、殺線蟲劑、植物活化劑、殺軟體動物劑或除草劑。

【0354】 根據本發明的組成物係以本身已知的方式，在不存在助劑的情況下，例如藉由研磨、篩選和/或壓縮固體活性成分；和在至少一種助劑的存在下，例如藉由將活性成分與一種或多種助劑密切混合和/或研磨來製備。該等用於製備組成物的方法和化合物 I 用於製備該等組成物的用途也是本發明的主題。

【0355】 用於該等組成物的施用方法（即防治上述類型的有害生物的方法）諸如噴霧、霧化、撒粉、刷塗、拌種、撒播或澆灌 - 它們以適於普遍情況的預期目的來選擇 - 以及該等組成物用於防治上述類型的有害生物的用途係本發明的其他主題。典型的濃度比係在0.1與1000 ppm之間、較佳的是在0.1與500 ppm之間的活性成分。每公頃的施用量總體上係1 g至2000 g活性成分/公頃，特別是10至1000 g/ha、較佳的是10至600 g/ha。

【0356】 在作物保護領域中較佳的施用方法係施用至植物的葉（葉部施用），可以選擇施用的頻率和量以與被所討論的有害生物侵染的風險相匹配。

可替代地，可以藉由用液體組成物將植物的場所浸透或者藉由將呈固體形式的活性成分摻入植物的場所（例如摻入土壤，例如以顆粒的形式摻入（土壤施用））而使活性成分經由根系（內吸作用）到達植物。在水稻作物的情況下，可以將此類顆粒劑計量地加入淹水的稻田中。

【0357】 本發明的化合物及其組成物還適用於保護植物繁殖材料（例如種子，諸如果實、塊莖或籽粒（kernel），或者苗圃植物）免受上述類型的有害生物侵襲。可以在種植前將繁殖材料用該化合物處理，例如可以在播種前對種子進行處理。可替代地，可以藉由將籽粒浸漬入液體組成物中或藉由施用一層固體組成物來將化合物施用至種子籽粒（包衣）。還以在將繁殖材料種植在施用地點時施用該組成物，例如在條播期間將該組成物施用到種子犁溝中。該等用於植物繁殖材料的處理方法和如此處理的植物繁殖材料係本發明的另外的主題。典型的處理量將取決於有待防治的植物以及有害生物/真菌，並且總體上為在1至200克/100 kg種子之間、較佳的是在5至150克/100 kg種子之間、諸如在10至100克/100 kg種子之間。

【0358】 術語種子包括所有種類的種子以及植物繁殖體，包括但不限於實生種子（true seeds）、種子塊、根蘖（sucker）、穀粒（corn）、球莖、果實、塊莖、穀物（grain）、根莖、插條、切芽（cut shoots）等並且在較佳的實施方式中意指實生種子。

【0359】 本發明還包括用式I的化合物包衣或處理的或含有其的種子。術語「包衣或處理的和/或含有其的」通常表示在施用的時候，活性成分主要在種子的表面上，儘管該成分的較多或較少部分可能滲透到種子材料中，這取決於施用的方法。當所述種子產品被（再）種植時，它可以吸收活性成分。在一個實施方式中，本發明可提供其上附著有式I的化合物的植物繁殖材料，該式I的化合物包括選自表A-1至A-17和表P的那些。此外，由此可提供一種組成物，該組

成物包含用式I的化合物處理的植物繁殖材料，該式I的化合物包括選自表A-1至A-17和表P的那些。

【0360】 種子處理包括本領域中已知的所有合適的種子處理技術，諸如拌種、種子包衣、種子撒粉、浸種以及種子造粒。式I的化合物（包括選自表A-1至A-17和表P的那些）的種子處理應用可以藉由任何已知的方法進行，例如在播種前或播種/種植種子期間對種子進行噴霧或撒粉。

生物學實施例：

實施例B1：對抗海灰翅夜蛾（埃及棉葉蟲）的活性

【0361】 將棉花葉圓片置於24孔微量滴定板中的瓊脂上並且用從10'000 ppm DMSO儲備溶液製備的水性測試溶液進行噴霧。乾燥之後，將葉圓片用五隻L1期幼蟲侵染。在侵染後3天後，相比於未處理的樣品，針對死亡率、拒食效果以及生長抑制對該等樣品進行評估。當該等類別（死亡率、拒食效果和生長抑制）中的至少一個高於未處理的樣品時，給出了測試樣品對海灰翅夜蛾的防治。

【0362】 以下化合物在200 ppm施用量下產生至少80%的防治：P1、P3、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10。

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

【0363】 將具有人工飲食的24孔微量滴定板用從10'000 ppm DMSO儲備溶液製備的水性測試溶液藉由移液進行處理。乾燥之後，將板用L2期幼蟲侵染（10至15隻/孔）。在侵染後5天後，相比於未處理的樣品，針對死亡率和生長抑制對該等樣品進行評估。

【0364】 以下化合物在200 ppm施用量下在兩個類別（死亡率或生長抑制）中至少一個方面給出了至少80%的效果：P1、P2、P3、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10。

實施例B3：對抗黃瓜條葉甲（玉米根蟲）的活性

【0365】 將置於24孔微量滴定板中瓊脂層上的玉米芽藉由噴霧用從10'000 ppm DMSO儲備溶液製備的水性測試溶液進行處理。乾燥之後，將板用L2期幼蟲侵染（6至10隻/孔）。在侵染後4天後，相比於未處理的樣品，針對死亡率和生長抑制對該等樣品進行評估。

【0366】 以下化合物在200 ppm施用量下在兩個類別(死亡率或生長抑制)中至少一個方面給出了至少80%的效果：P1、P2、P3、P4、P6、P7、P8、P9、P10、P11。

實施例B4：對抗桃蚜（綠色桃蚜蟲）的活性

【0367】 將向日葵葉圓片置於24孔微量滴定板中的瓊脂上並且用從10'000 ppm DMSO儲備溶液製備的水性測試溶液進行噴霧。乾燥之後，將該等葉圓片用混合年齡的蚜蟲群體進行侵染。在侵染後6天後，針對死亡率對該等樣品進行評估。

【0368】 以下化合物在200 ppm施用量下產生至少80%的死亡率：P1、P2、P3、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11。

實施例B5：對抗桃蚜（綠色桃蚜蟲）的活性

【0369】 將受到混合年齡的蚜蟲群體侵染的豌豆幼苗的根部直接置於從10'000 DMSO儲備溶液製備的水性測試溶液中。在將幼苗放置在測試溶液中之後6天，針對死亡率對該等樣品進行評估。

【0370】 以下化合物在24 ppm測試量下產生至少80%的死亡率：P1、P2、P3、P4、P5、P6、P7、P9、P10。

實施例B6：對抗煙粉虱（*Bemisia tabaci*）（棉粉虱）的活性

【0371】 將棉花葉圓片置於24孔微量滴定板中的瓊脂上並且用從10'000 ppm DMSO儲備溶液製備的水性測試溶液進行噴霧。乾燥之後，將葉圓片用成年

粉虱進行侵染。在培養後6天後，針對死亡率對該等樣品進行檢查。

【0372】 以下化合物在200 ppm施用量下產生至少80%的死亡率：P1、P2、P3、P4、P5、P6、P7、P9、P10、P11。

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

【0373】 將在24孔微量滴定板中的瓊脂上的大豆葉片用從10'000 ppm DMSO儲備溶液製備的水性測試溶液進行噴霧。乾燥之後，用N-2期若蟲對葉片進行侵染。在侵染後5天後，相比於未處理的樣品，針對死亡率和生長抑制對該等樣品進行評估。

【0374】 以下化合物在200 ppm施用量下在兩個類別(死亡率或生長抑制)中至少一個方面給出了至少80%的效果：P1、P2、P3、P4、P6、P7、P9、P11。

實施例B8：對抗西花薊馬(*Frankliniella occidentalis*)(西方花薊馬(Western flower thrips))的活性

【0375】 將向日葵葉圓片置於24孔微量滴定板中的瓊脂上並且用從10'000 DMSO儲備溶液製備的水性測試溶液進行噴霧。乾燥之後，將葉圓片用混合年齡的花薊馬群體進行侵染。在侵染後7天後，針對死亡率對該等樣品進行評估。

【0376】 以下化合物在200 ppm施用量下產生至少80%的死亡率：P7、P9、P11。

實施例B9：對抗小菜蛾 (*Plutella xylostella*) (小菜蛾 (Diamond back moth)) 的活性

【0377】 將具有人工飲食的24孔微量滴定板用從10'000 ppm DMSO儲備溶液製備的水性測試溶液藉由移液進行處理。乾燥之後，將菜蛾屬卵吸移穿過塑膠模板 (plastic stencil) 到凝膠印跡紙上並且將板用其封閉。在侵染後8天後，相比於未處理的樣品，針對死亡率和生長抑制對該等樣品進行評估。

【0378】 以下化合物在200 ppm施用量下在兩個類別(死亡率或生長抑制)中至少一個方面給出了至少80%的效果：P11。

實施例B10：對抗二斑葉蟎 (*Tetranychus urticae*) (二點葉蟎 (Two-spotted spider mite)) 的活性

【0379】 將在24孔微量滴定板中的瓊脂上的豆葉圓片用從10'000 ppm DMSO儲備溶液製備的水性測試溶液進行噴霧。乾燥之後，將葉圓片用混合年齡的蟎群體進行侵染。在侵染之後8天後，針對混合群體 (活動階段) 的死亡率對該等樣品進行評估。

【0380】 以下化合物在200 ppm施用量下產生至少80%的死亡率：P1、P11。
實施例B11：對抗褐飛虱 (*Nilaparvata lugens*) (褐稻飛蟲 (Brown plant hopper)) 的活性

【0381】 利用稀釋的測試溶液在噴霧室中對水稻植株進行處理。乾燥之後，用約20隻N3期若蟲對植株進行侵染。在處理後7天後，取出成蟲並且在處理後15天，針對對F1代的影響，對該等樣品進行評估。

【0382】 以下化合物在50 ppm施用量下產生至少80%的死亡率：P1、P2、P3、P9。

實施例B12：對抗褐飛虱 (*Nilaparvata lugens*) (褐稻飛蟲 (Brown plant hopper)) 的活性

【0383】 將在營養溶液中栽培的水稻植株用進入營養栽培系統中的稀釋的測試溶液處理。在施用後1天後，將植物用約20隻N3期若蟲進行侵染。在侵染後7天後，針對死亡率和生長調節對樣品進行評估。

【0384】 以下化合物在12.5 ppm施用量下產生至少80%的死亡率：P1、P2、P3、P6、P7、P9。

實施例B13：對抗甜菜胞囊線蟲 (*Heterodera schachtii*) 的活性 (在96孔板中進

行幼體活動的體外剖析)

【0385】 用TECAN機器人從10'000 ppm DMSO儲備溶液製備測試溶液，以獲得20 μ L的500 ppm、100 ppm、50 ppm、25 ppm、12.5 ppm和6.25 ppm。對於每種濃度生產三個複製品。向每個孔中添加80 μ L線蟲溶液，該線蟲溶液含有100至150隻新收穫的第二階段幼蟲的甜菜胞囊線蟲。將板蓋住並且在室溫下在黑暗中儲存並且培養48小時。使用成像工具測量在經處理的孔中的暴露的幼蟲的活動，並且與12個未處理的複製品的平均值進行比較。

【0386】 以下化合物在100 ppm下48 h後實現至少60%的防治：P2、P3、P9。實施例B14：對抗南方根結線蟲 (*Meloidogyne incognita*) 的活性 (在96孔板中進行幼體活動的體外剖析)

【0387】 用TECAN機器人從10'000 ppm DMSO儲備溶液製備測試溶液，以獲得20 μ L的1000 ppm、200 ppm、100 ppm、50 ppm、25 ppm和12.5 ppm。對於每種濃度生產三個複製品。向每個孔中添加80 μ L線蟲溶液，該線蟲溶液含有100至150隻新收穫的第二階段幼蟲的南方根結線蟲。將板蓋住並且在室溫下在黑暗中儲存並且培養48小時。使用成像工具測量在經處理的孔中的暴露的幼體的活動，並且與12個未處理複製品的平均值進行比較。

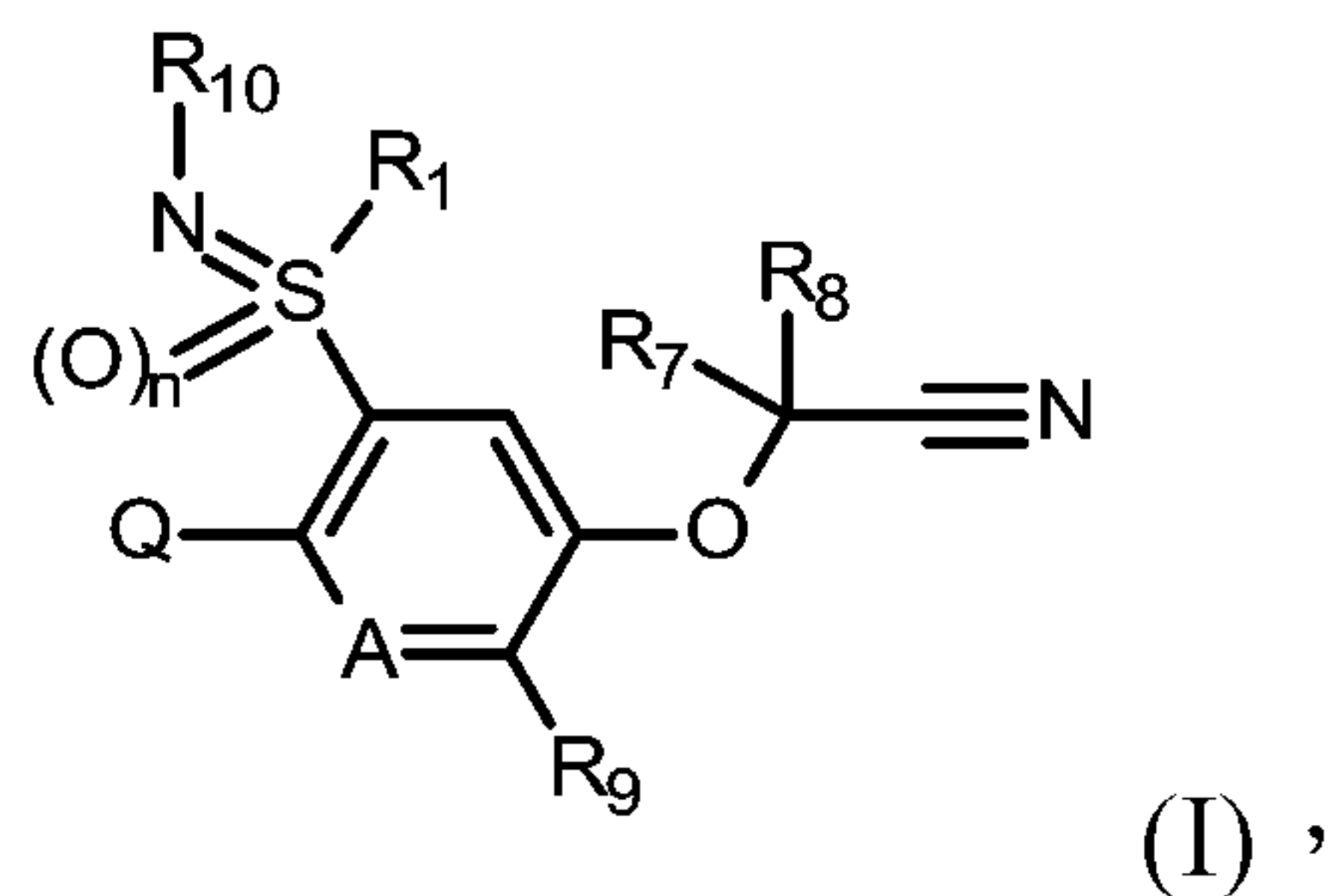
【0388】 以下化合物在200 ppm下48 h後實現至少60%的防治：P9。

【符號說明】

無

【發明申請專利範圍】

【第1項】一種式 (I) 之化合物，



其中

A係CH或N；

R₁係C₁-C₄烷基；

R₇和R₈彼此獨立地是氫、鹵素或C₁-C₆烷基；

R₉係氫或C₁-C₄烷基；

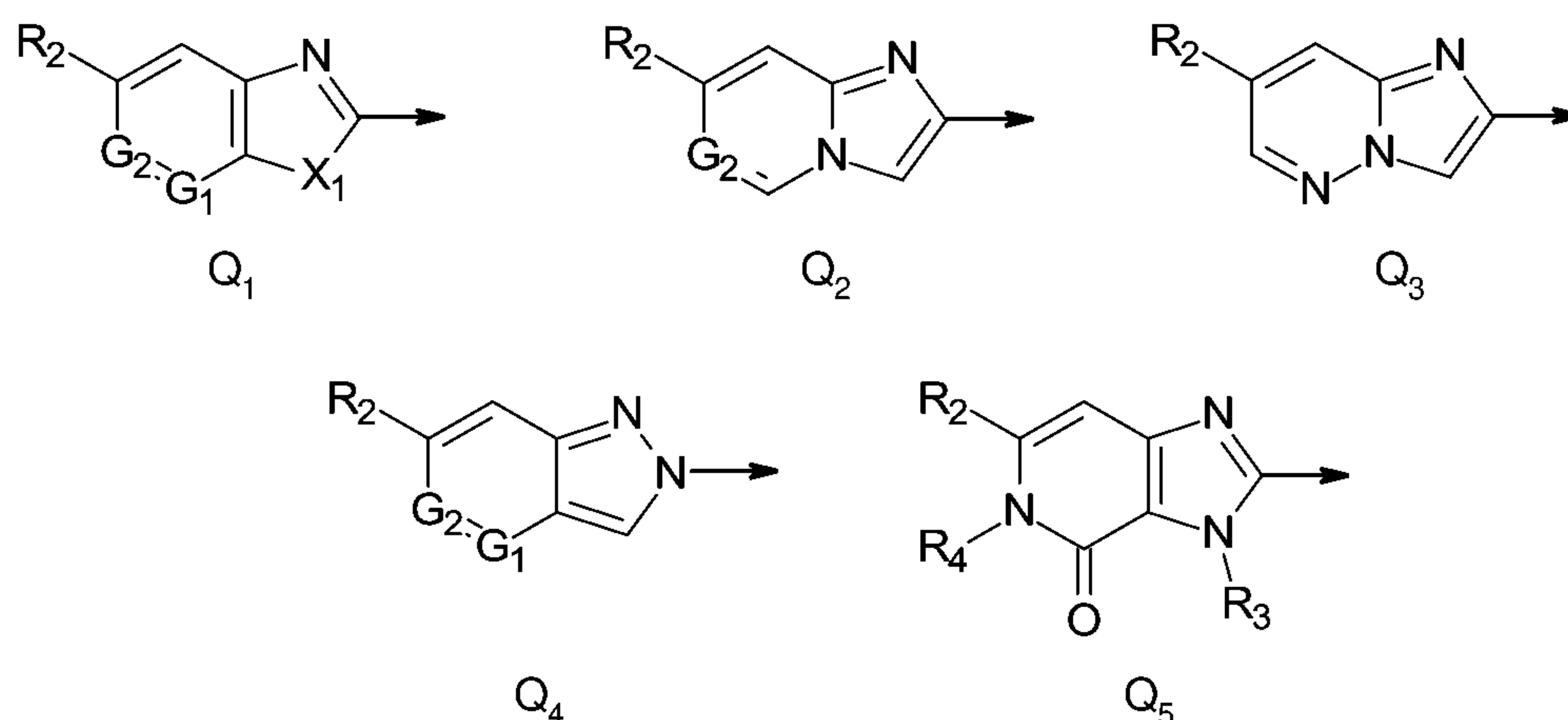
R₁₀係氫、氰基、-C(O)R₂₅、-C(O)OR₂₆或C₁-C₆烷基；

R₂₅係氫、C₁-C₆烷基或C₁-C₆鹵代烷基；

R₂₆係C₁-C₆烷基或C₁-C₆鹵代烷基；

n係0或1；

Q係選自以下群組的基團，該群組由以下各項組成：式Q₁至Q₅



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

X_1 係O、S或 NR_3 ；

R_3 係 C_1 - C_4 烷基；

R_2 係鹵素、 C_1 - C_6 鹵代烷基、 C_1 - C_4 鹵代烷基氫硫基、 C_1 - C_4 鹵代烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 鹵代烷基磺醯基或 C_1 - C_6 鹵代烷氧基；

G_1 和 G_2 彼此獨立地是N或CH；

R_4 係 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵代烷基、 C_3 - C_6 環烷基或 C_1 - C_4 烷氧基；

或該等化合物之一的農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物。

【第2項】如申請專利範圍第1項所述之化合物，其中

A係CH或N；

R_1 係乙基、丙基或異丙基；較佳的是乙基

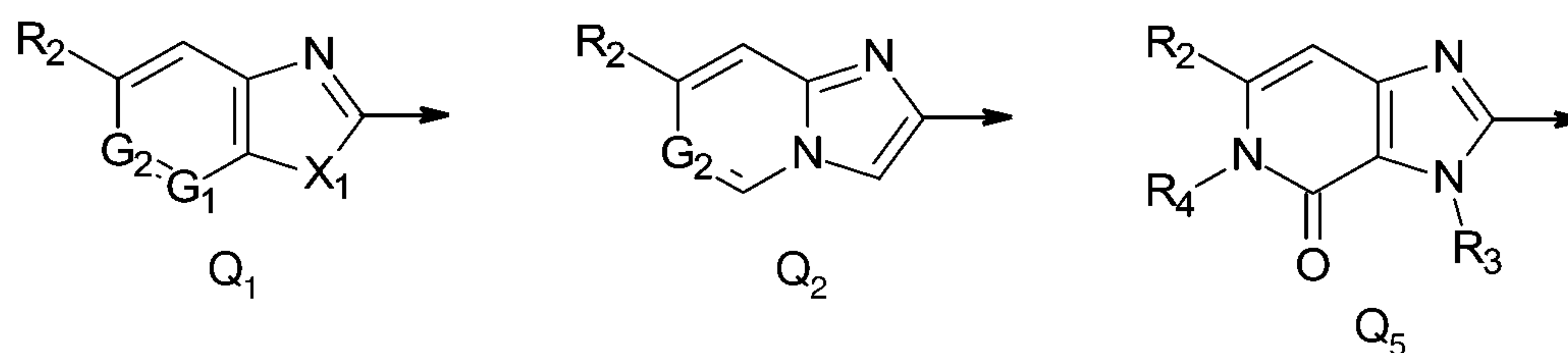
R_{10} 係氫、氰基或 $-C(O)R_{25}$ ，其中 R_{25} 係 C_1 - C_2 鹵代烷基；較佳的是氫

R_9 係氫、甲基或乙基；較佳的是氫或甲基；並且

n係1。

【第3項】如申請專利範圍第1項所述之化合物，其中

Q係選自 Q_1 、 Q_2 和 Q_5 的基團



其中箭頭指示與摻入有基團A的環的附接點；

並且其中

R_2 係 C_1 - C_2 氟烷基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、二氟甲基氫硫基、二氟甲基亞磺醯基、或二氟甲基磺醯基；

X_1 係 NCH_3 ；

R_3 係甲基；

R_4 係甲基、乙基、2,2,2-三氟乙基、甲氧基或環丙基；並且

G_1 和 G_2 彼此獨立地是N或CH。

【第4項】如申請專利範圍第3項所述之化合物，其中

R_2 係三氟甲基、五氟乙基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；

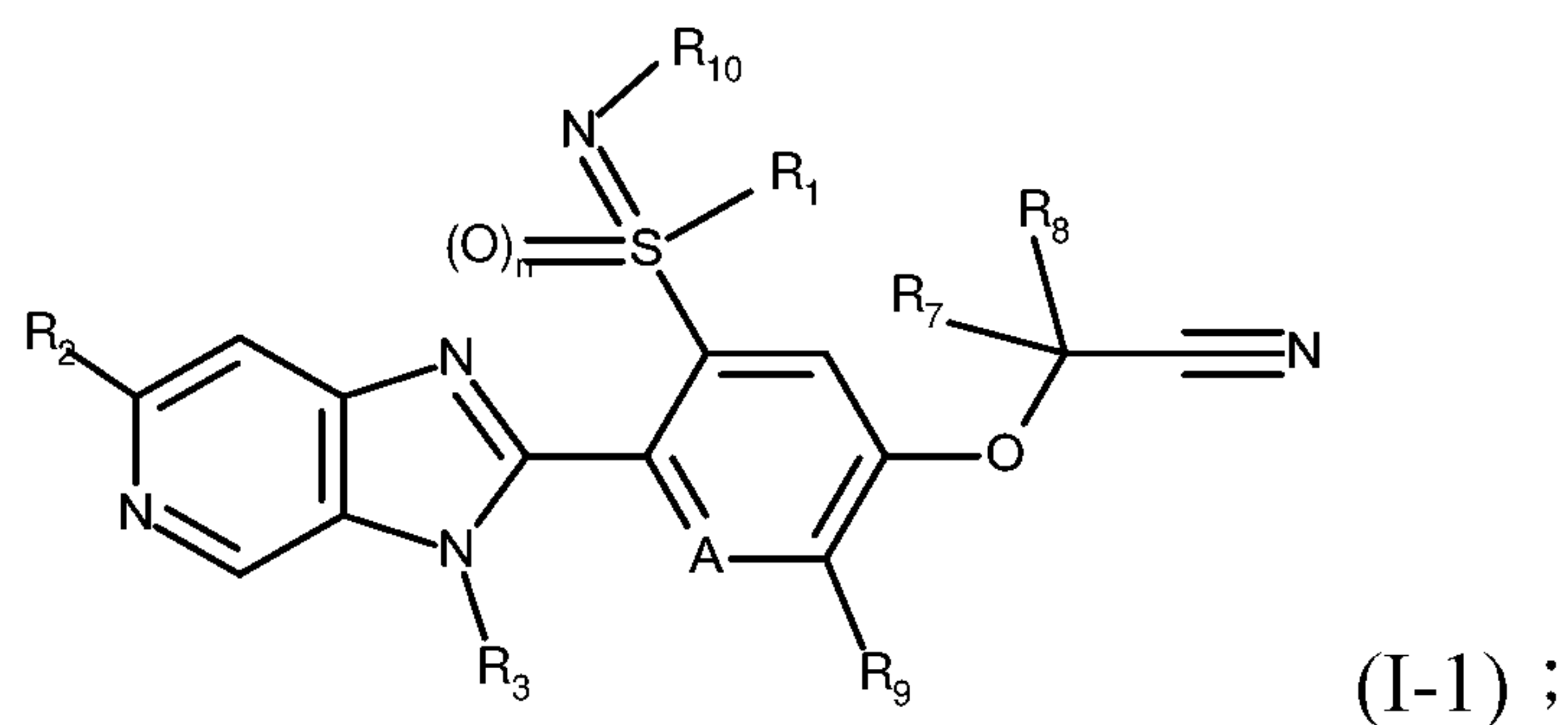
X_1 係 NCH_3 ；

R_3 係甲基；

R_4 係乙基、甲氧基或環丙基；並且

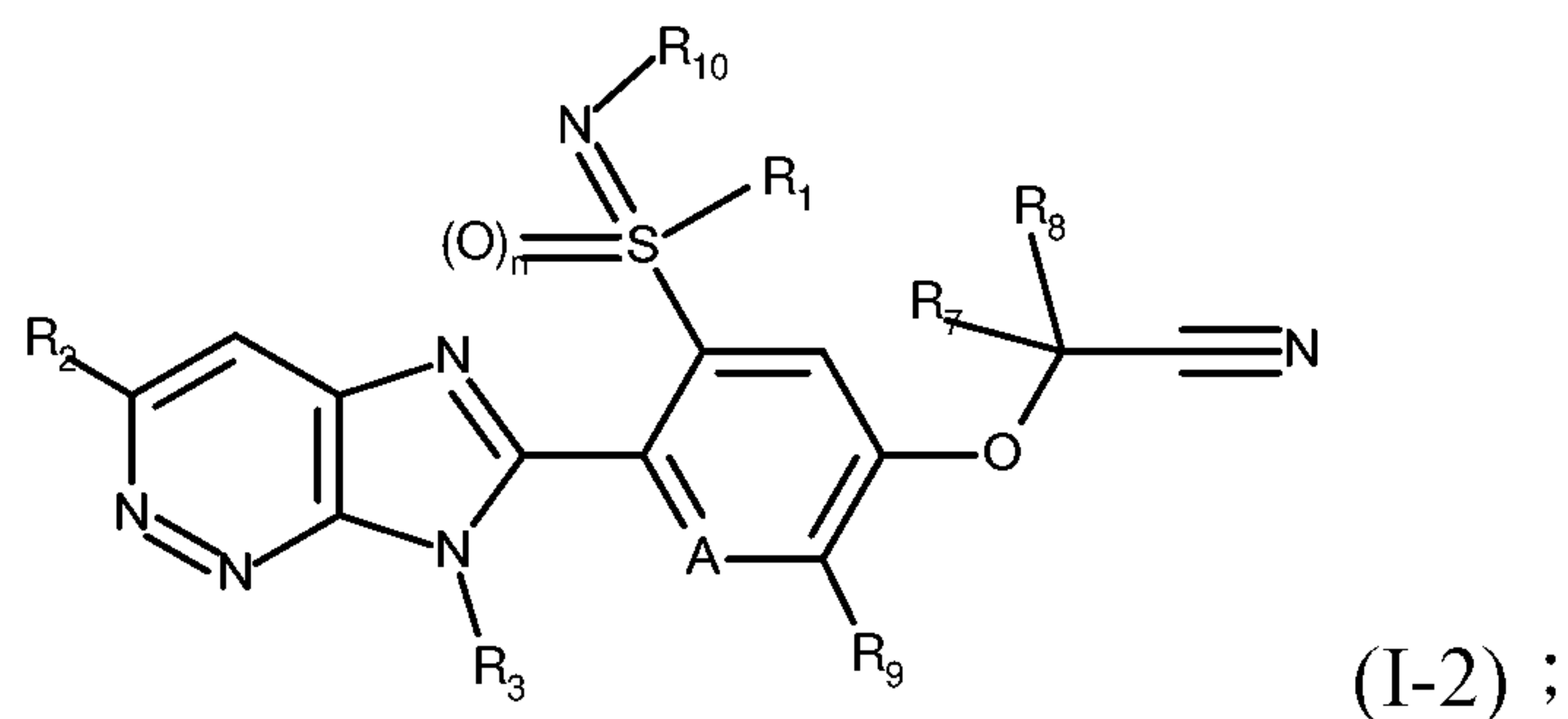
G_1 係N並且 G_2 係CH，或者 G_1 係CH並且 G_2 係N，或者 G_1 和 G_2 都是N。

【第5項】如申請專利範圍第1項所述之式I的化合物，該化合物由式I-1的化合物表示



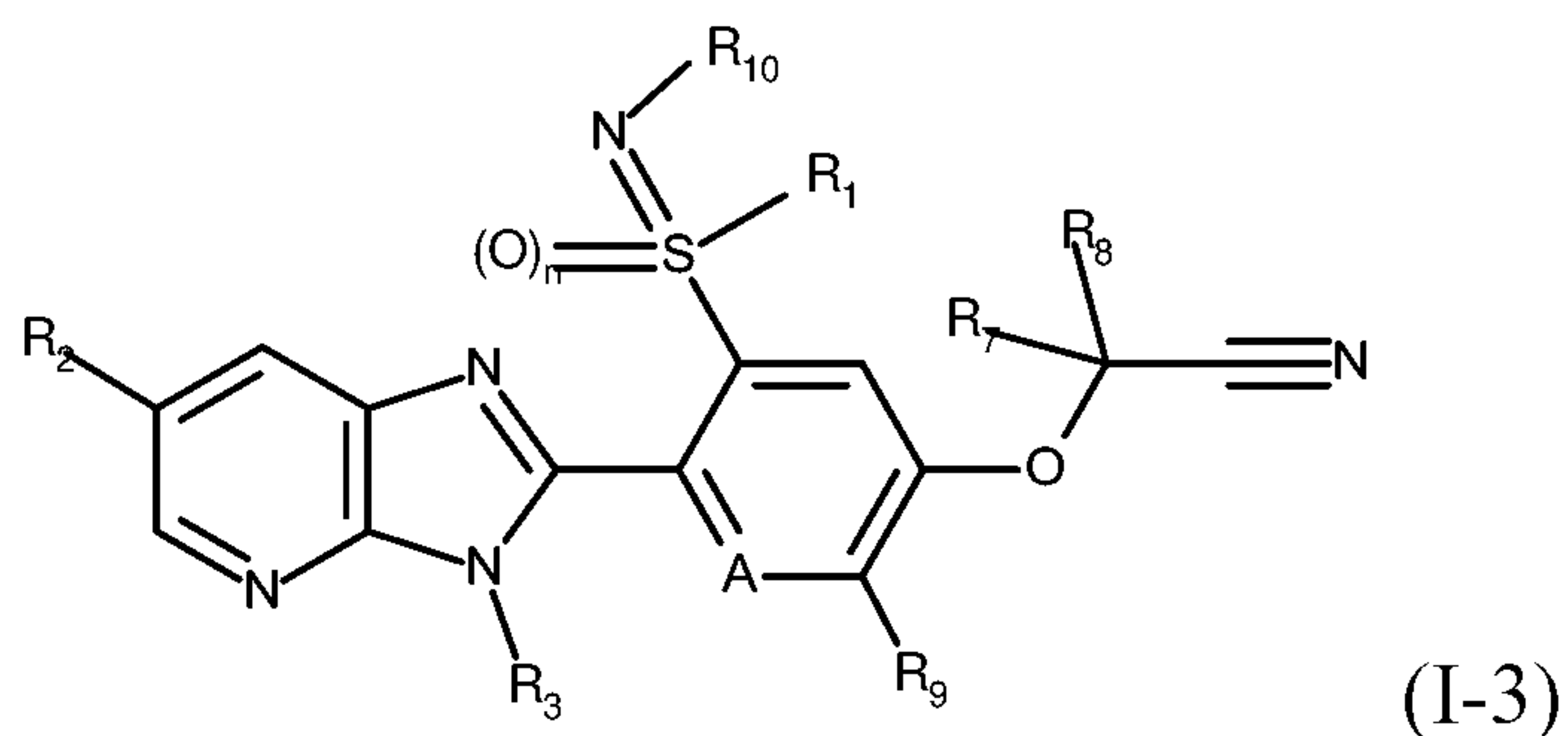
其中 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、A和n係如申請專利範圍第1項中式I所定義的。

【第6項】如申請專利範圍第1項所述之式I的化合物，該化合物由式I-2的化合物表示



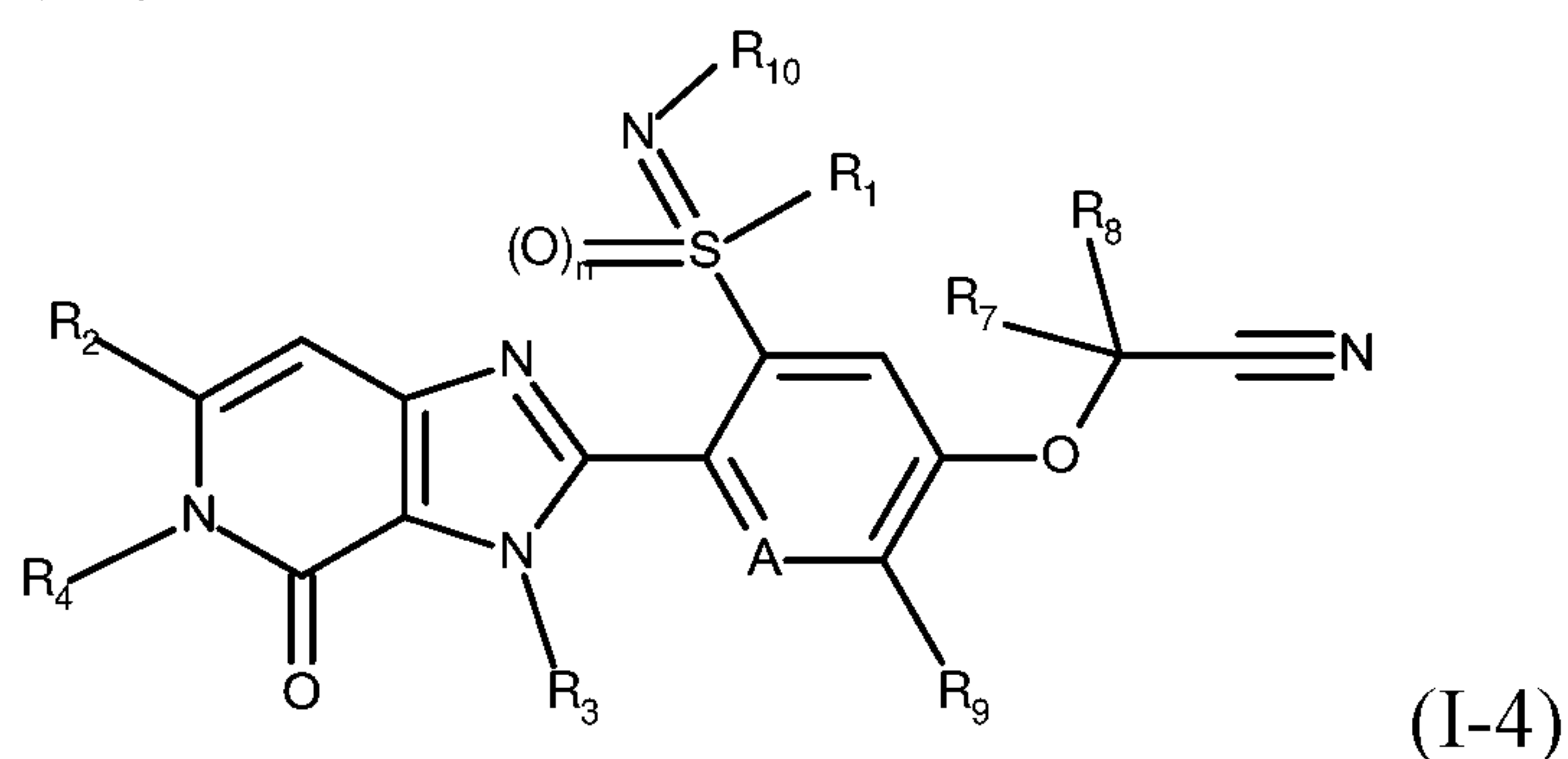
其中 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、A和n係如申請專利範圍第1項中式I所定義的。

【第7項】如申請專利範圍第1項所述之式I的化合物，該化合物由式I-3的化合物表示



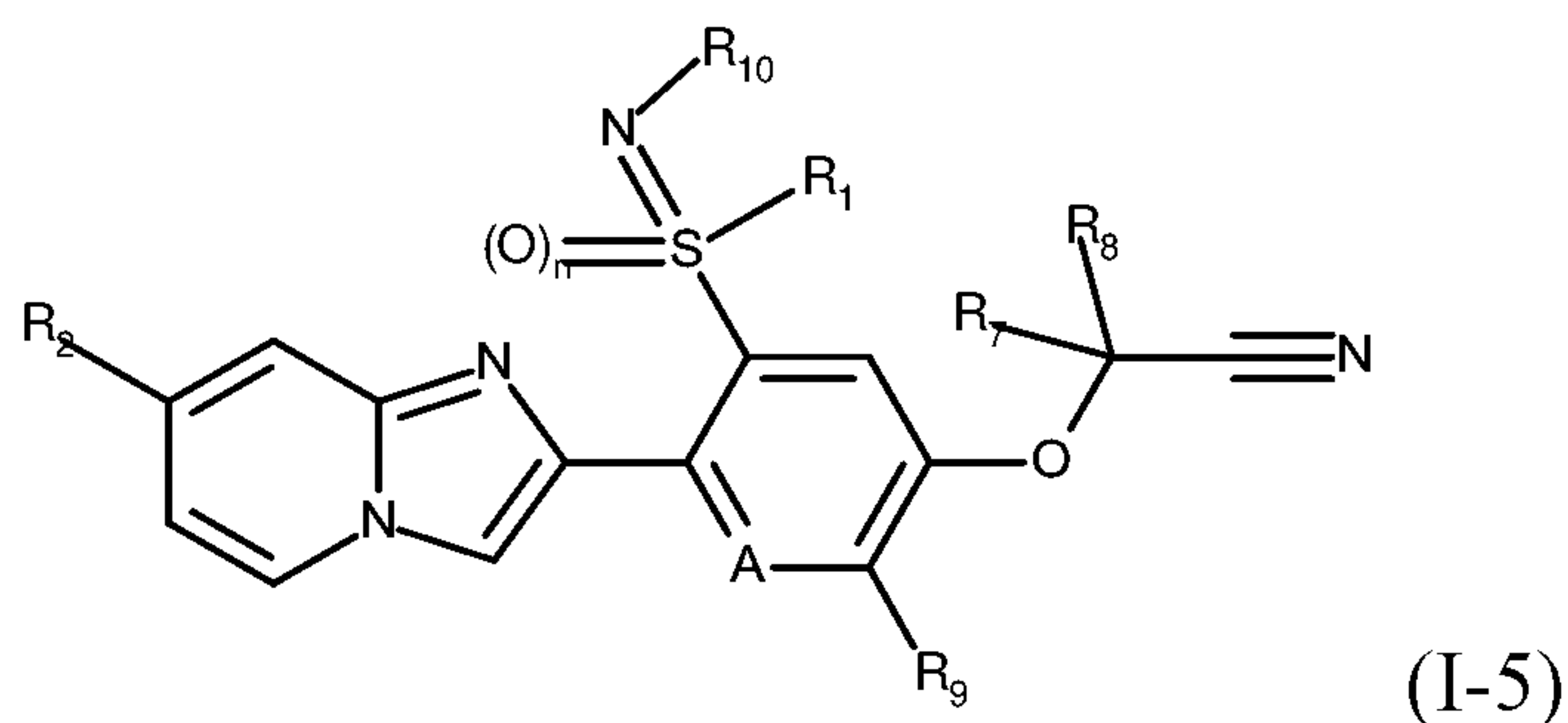
其中 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、A和n係如申請專利範圍第1項中式I所定義的。

【第8項】如申請專利範圍第1項所述之式I的化合物，該化合物由式I-4的化合物表示



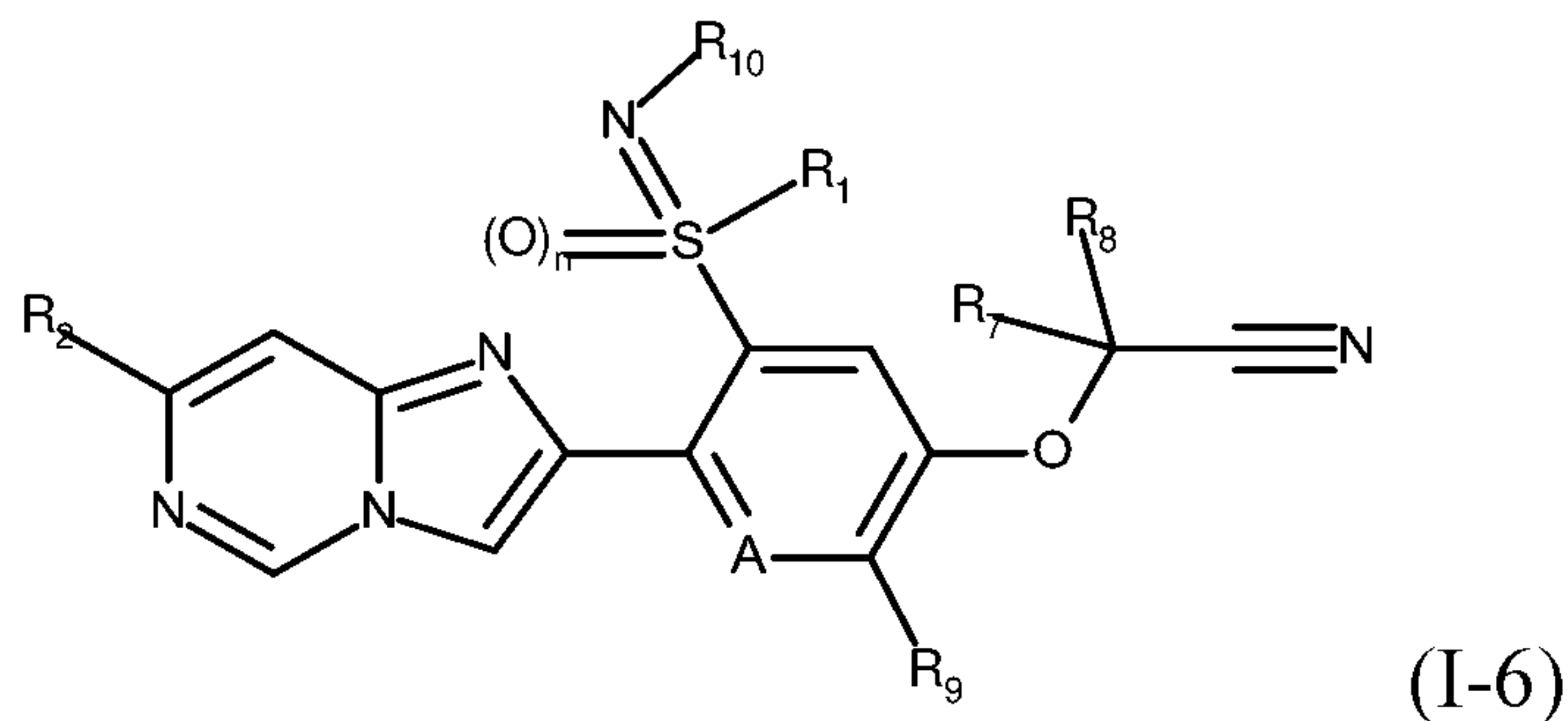
其中 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、A和n係如申請專利範圍第1項中式I所定義的。

【第9項】如申請專利範圍第1項所述之式I的化合物，該化合物由式I-5的化合物表示



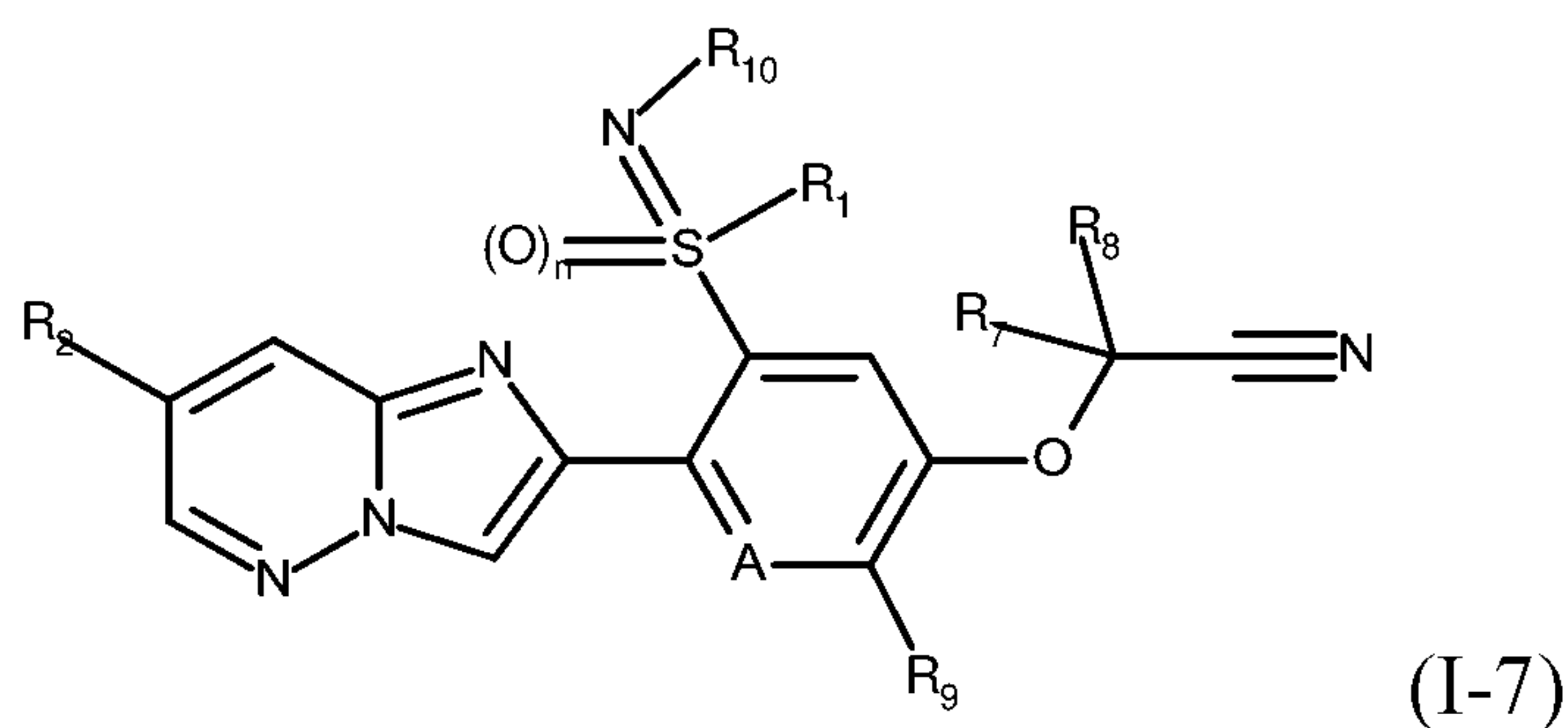
其中 R_1 、 R_2 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 A 和 n 係如申請專利範圍第1項中式I所定義的。

【第10項】如申請專利範圍第1項所述之式I的化合物，該化合物由式I-6的化合物表示



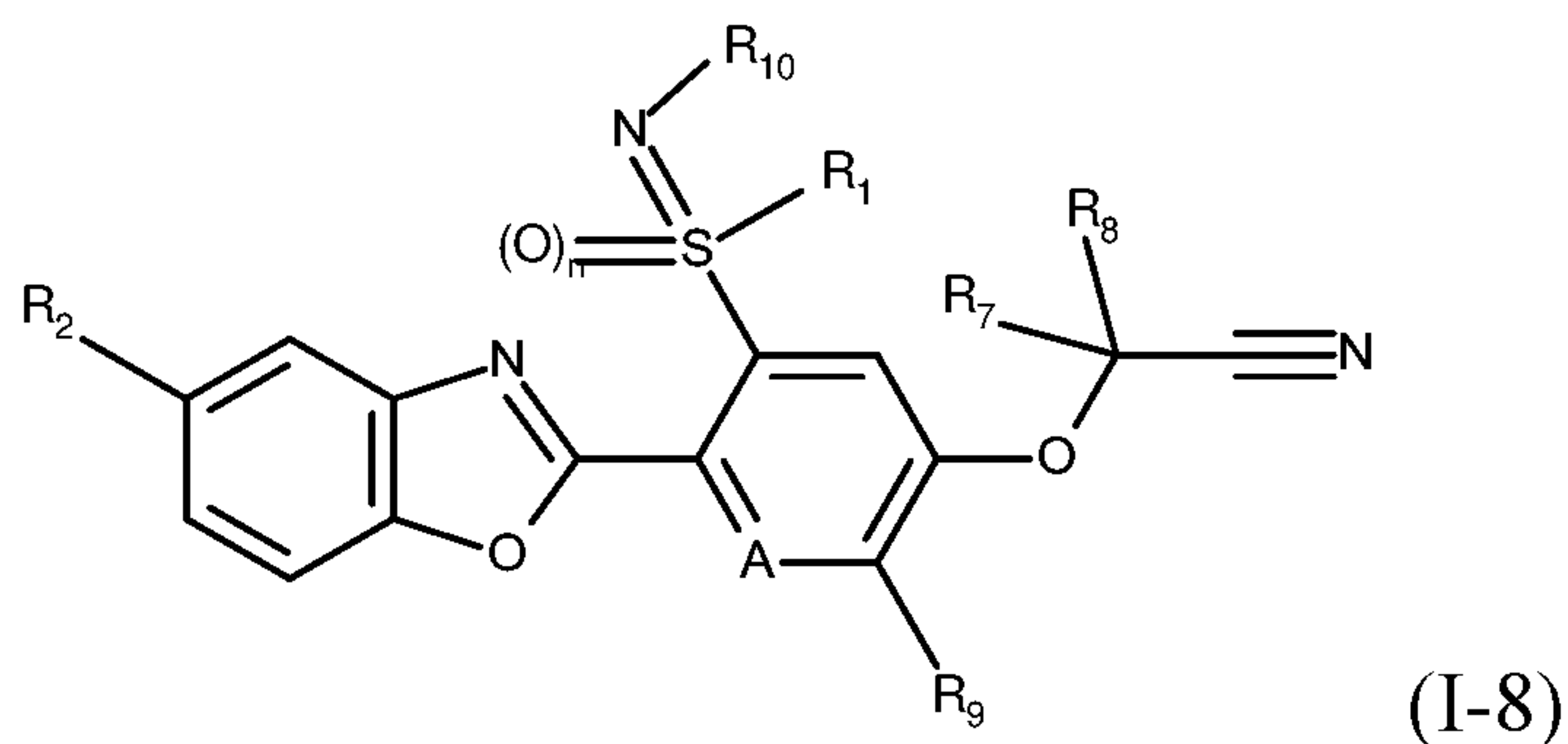
其中 R_1 、 R_2 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 A 和 n 係如申請專利範圍第1項中式I所定義的。

【第11項】如申請專利範圍第1項所述之式I的化合物，該化合物由式I-7的化合物表示



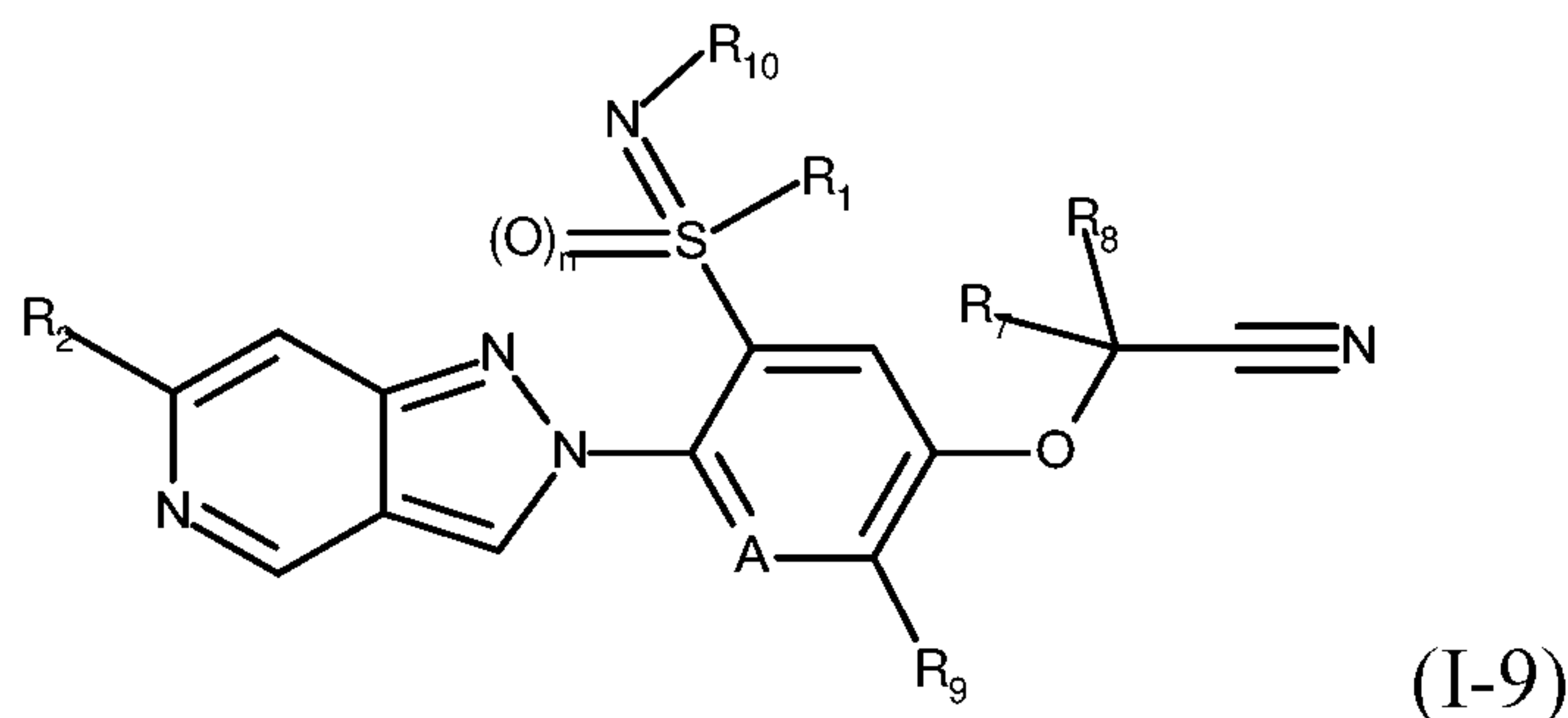
其中 R_1 、 R_2 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 A 和 n 係如申請專利範圍第1項中式I所定義的。

【第12項】如申請專利範圍第1項所述之式I的化合物，該化合物由式I-8的化合物表示



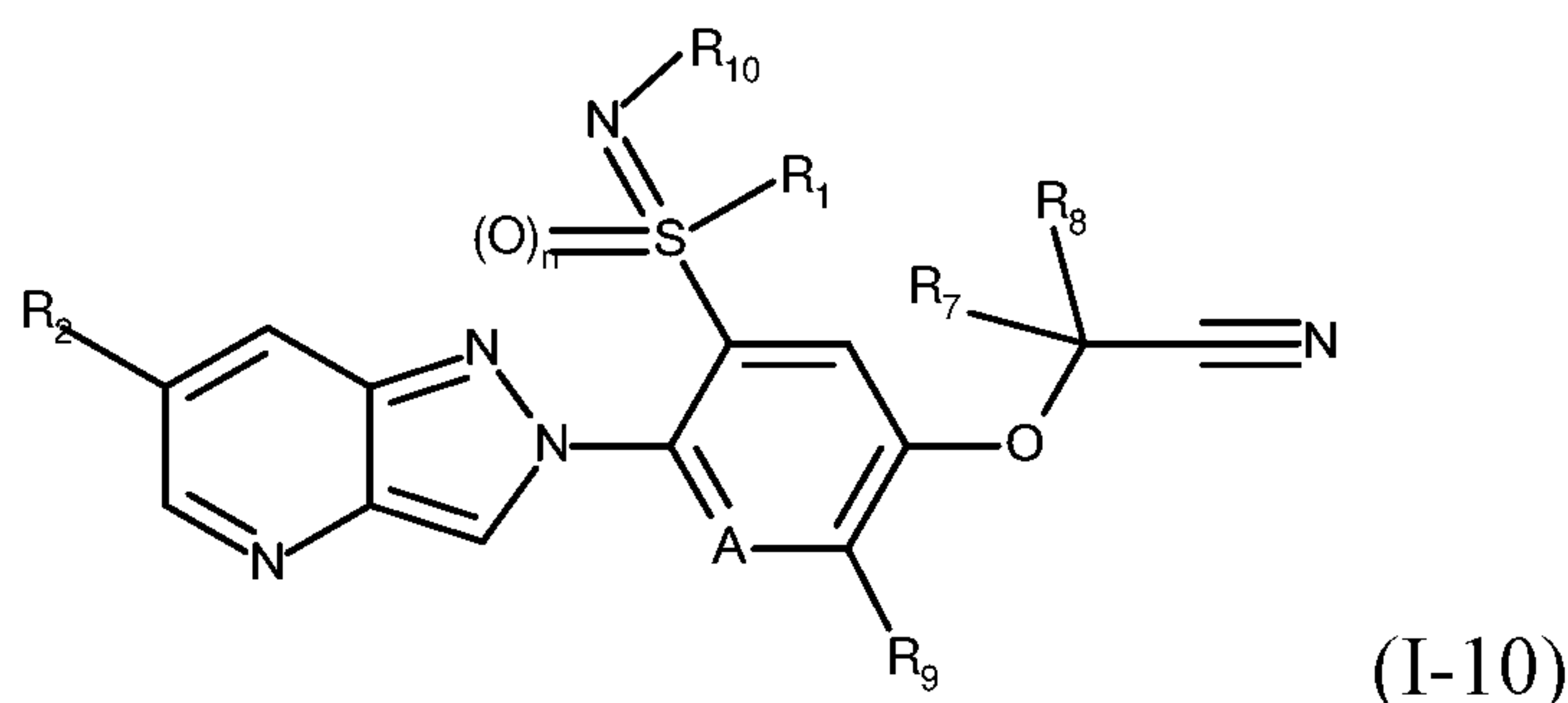
其中 R_1 、 R_2 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、A和n係如申請專利範圍第1項中式I所定義的。

【第13項】如申請專利範圍第1項所述之式I的化合物，該化合物由式I-9的化合物表示



其中 R_1 、 R_2 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、A和n係如申請專利範圍第1項中式I所定義的。

【第14項】如申請專利範圍第1項所述之式I的化合物，該化合物由式I-10的化合物表示



其中 R_1 、 R_2 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、A和n係如申請專利範圍第1項中式I所定義的。

【第15項】如申請專利範圍第5-14項中任一項所述之式I的化合物，其中

A係CH或N，較佳的是A係N；

R_1 係乙基、丙基或異丙基；較佳的是乙基；

R_2 係三氟甲基、五氟乙基或三氟甲基氫硫基；較佳的是 R_2 係三氟甲基；

R_7 係氫、甲基或乙基，較佳的是甲基；

R₈係甲基或乙基，較佳的是甲基；

R₉和R₁₀均是氫；

n係1；並且

在式I-1、I-2、I-3、和I-4的化合物的情況下：R₃係甲基；並且

在式I-4的化合物的情況下：R₄係乙基或環丙基。

【第16項】如申請專利範圍第1項所述之式I的化合物，該化合物選自由以下各項組成的群組：

2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P1）；

2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]嗒吡啶-6-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P2）；

2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P3）；

2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P4）；

2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-2-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P5）；

2-[[6-[5-乙基-3-甲基-4-側氧基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-5-(乙基磺醯亞胺基)-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P6）；

2-[[6-[5-環丙基-3-甲基-4-側氧基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-5-(乙基磺醯亞胺基)-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P7）；

2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P8）；

2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-(1,1,2,2,2-五氟乙基)咪唑并[1,2-c]嘓啶-2-基]-3-

吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P9）；

2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P10）；和

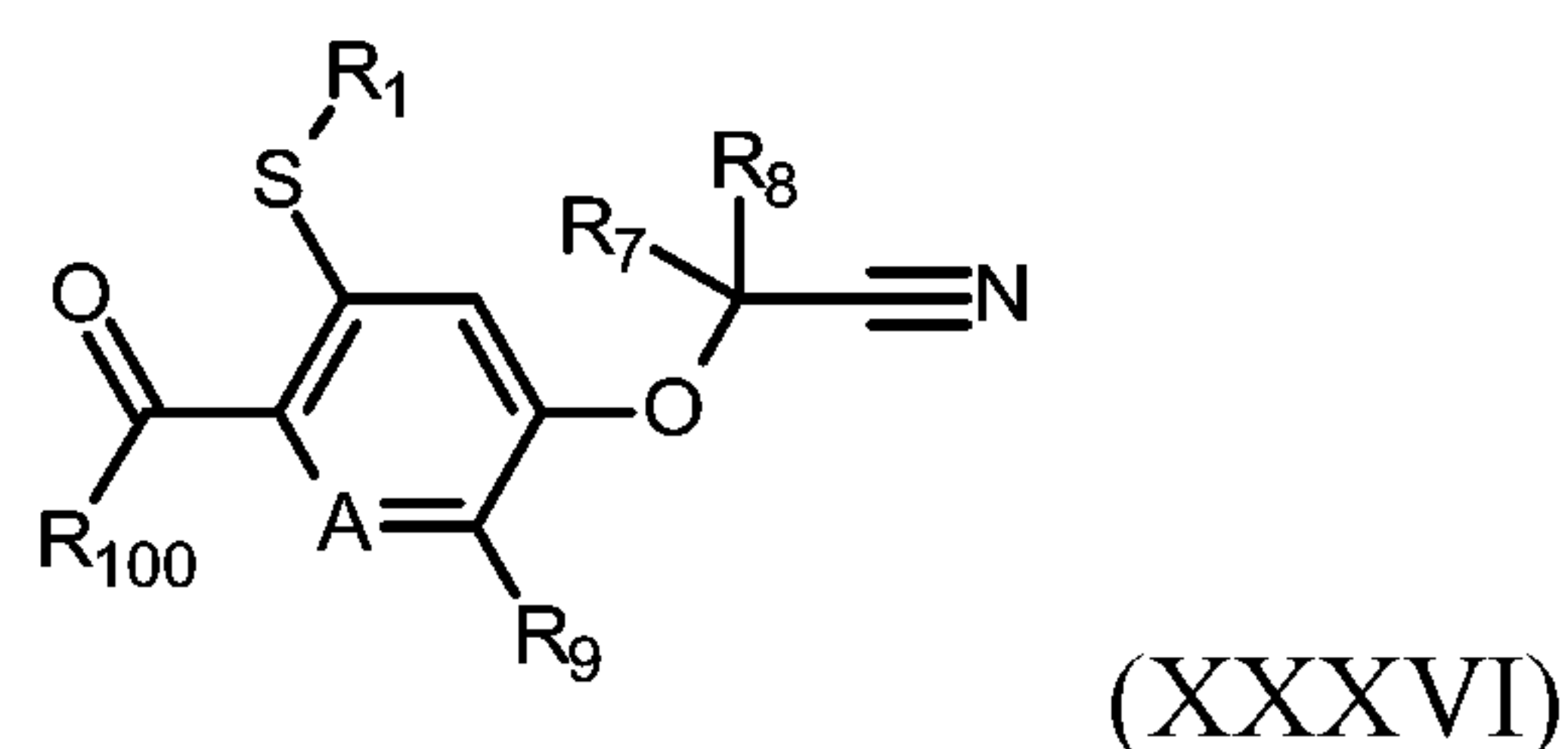
2-[[5-(乙基磺醯亞胺基)-6-[7-(三氟甲基氫硫基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈（化合物P11）。

【第17項】一種殺有害生物組成物，該殺有害生物組成物包含作為活性成分的在每種情況下呈游離形式或呈農用化學上可用的鹽形式的至少一種如申請專利範圍第1-16項中任一項所定義的式I的化合物或適當時其互變異構物，以及至少一種助劑。

【第18項】一種用於防治有害生物之方法，該方法包括將殺有害生物有效量的如申請專利範圍第1-16項中任一項所定義的式I的化合物或如申請專利範圍第17項所述之組成物施用於有害生物、有害生物的場所或易受有害生物攻擊的植物。

【第19項】一種用於保護植物繁殖材料免受有害生物攻擊之方法，該方法包括用如申請專利範圍第17項所述之組成物處理該繁殖材料或種植該繁殖材料的地點。

【第20項】一種式XXXVI的化合物，



其中

R₁、R₇、R₈、R₉和A係如上式I所定義的，並且R₁₀₀係OH、氯或C₁-C₄烷氧基。