



(12)发明专利

(10)授权公告号 CN 106572657 B

(45)授权公告日 2019.08.23

(21)申请号 201580036296.5

(22)申请日 2015.06.24

(65)同一申请的已公布的文献号
申请公布号 CN 106572657 A

(43)申请公布日 2017.04.19

(30)优先权数据
2014-138434 2014.07.04 JP
2014-162206 2014.08.08 JP
2014-194870 2014.09.25 JP

(85)PCT国际申请进入国家阶段日
2016.12.30

(86)PCT国际申请的申请数据
PCT/JP2015/068168 2015.06.24

(87)PCT国际申请的公布数据
W02016/002595 JA 2016.01.07

(73)专利权人 住友化学株式会社
地址 日本国东京都

(72)发明人 西村慎哉 赤山敦夫 龟崎将司

(74)专利代理机构 中科专利商标代理有限责任
公司 11021

代理人 陈平

(51)Int.Cl.
A01N 43/52(2006.01)
A01N 43/76(2006.01)
A01N 43/78(2006.01)
A01N 43/90(2006.01)
A01P 7/04(2006.01)

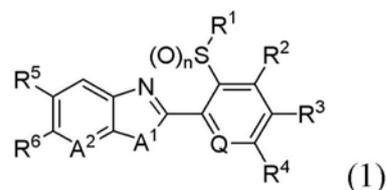
(56)对比文件
CN 103459387 A, 2013.12.18, 说明书第2,
51, 61, 81, 82页.
CN 103717598 A, 2014.04.09, 说明书第4, 5
页.
WO 2014104407 A1, 2014.07.03, 说明书第
2-3页.

审查员 南艳

权利要求书1页 说明书39页

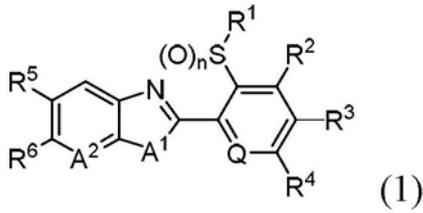
(54)发明名称
有害生物防治组合物及其用途

(57)摘要
包含由式(1)中表示的化合物(其中符号如说明书中所定义)和2,4-二氧化-1-(5-嘧啶基甲基)-3-[3-(三氟甲基)苯基]-2H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐的有害生物防治组合物对于有害生物具有特别的防治效力。提供了对于有害生物具有特别的防治效力的有害生物防治组合物。



CN 106572657 B

1. 一种用于防治有害生物的组合物的组合物,所述用于防治有害生物的组合物包含:
由式(1)表示的化合物:



其中,

A¹表示-NMe-、或氧原子,

A²表示=N-、=N(→O)-或=CH-,

Q表示=N-,

R¹表示C1-C6烷基,

R²和R⁴各自表示氢原子,

R³表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基、或氢原子,

R⁵表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基、-OR¹⁰或-S(O)_mR¹⁰,

R⁶表示-NR¹⁰R¹¹或氢原子,

R¹⁰和R¹¹彼此相同或不同,并且各自表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基,

m彼此独立地表示0、1或2,并且

n表示2,和

2,4-二氧化-1-(5-嘧啶基甲基)-3-[3-(三氟甲基)苯基]-2H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐,

其中所述由式(1)表示的化合物与2,4-二氧化-1-(5-嘧啶基甲基)-3-[3-(三氟甲基)苯基]-2H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐的比率按重量计在100:1至1:100的范围内。

2. 根据权利要求1所述的用于防治有害生物的组合物的组合物,其中A¹表示-NMe-。

3. 根据权利要求1所述的用于防治有害生物的组合物的组合物,其中A¹表示氧原子。

4. 根据权利要求1至3中任一项所述的用于防治有害生物的组合物的组合物,其中所述由式(1)表示的化合物与2,4-二氧化-1-(5-嘧啶基甲基)-3-[3-(三氟甲基)苯基]-2H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐的比率按重量计在10:1至1:10的范围内。

5. 一种用于防治有害生物的方法,所述方法包括向有害生物或有害生物生活的栖息地施用有效量的根据权利要求1至4中任一项所述的用于防治有害生物的组合物的组合物。

6. 一种用于防治有害生物的方法,所述方法包括向植物、植物种子、鳞茎或用于栽培所述植物的土壤施用有效量的根据权利要求1至4中任一项所述的用于防治有害生物的组合物的组合物。

有害生物防治组合物及其用途

技术领域

[0001] 本发明涉及用于防治有害生物的组合物和用于防治有害生物的方法。

背景技术

[0002] 迄今,已经知道许多化合物作为用于防治有害生物的组合物的活性成分(参见专利文献1至3,以及非专利文献1)。

[0003] 引用清单

[0004] 专利文献

[0005] 专利文献1:WO 2013/018928小册子

[0006] 专利文献2:WO 2012/092115小册子

[0007] 专利文献3:WO 2014/104407小册子

[0008] 非专利文献

[0009] 非专利文献1:农药手册 (THE Pesticide Manual) - 第16版,由BCPC出版,ISBN 9781901396867

[0010] 发明概述

[0011] (本发明要解决的技术问题)

[0012] 本发明的一个目的是提供对于有害生物具有优异防治效力的用于防治有害生物的组合物。

[0013] (解决问题的手段)

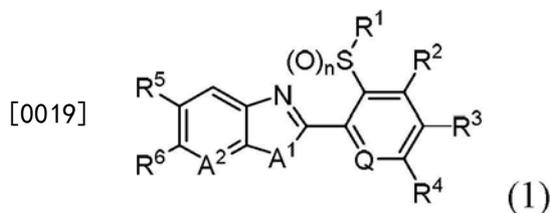
[0014] 本发明的发明人深入研究以找到一种对有害生物具有优异防治效力的用于防治有害生物的组合物。作为结果,他们已发现这样的一种组合物对有害生物具有优异的防治效力,所述组合物包含由以下提及的式(1)表示的化合物,和

[0015] 2,4-二氧化-1-(5-嘧啶基甲基)-3-[3-(三氟甲基)苯基]-2H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐(下文中,称为“Triflumezopyrim”)。

[0016] 本发明提供例如以下实施方案。

[0017] [1]一种用于防治有害生物的组合物,所述用于防治有害生物的组合物包含

[0018] 由式(1)表示的化合物:



[0020] 其中,

[0021] A¹表示-NR⁷-、氧原子或硫原子,

[0022] A²表示=N-、=N(→O)-或=CR⁸-,

[0023] Q表示=N-或=N(→O)-,

[0024] R^1 表示任选地具有一个或多个选自X组的原子或基团的C1-C6烷基,

[0025] R^2 、 R^3 和 R^4 彼此相同或不同,并且各自表示任选地具有一个或多个选自X组的原子或基团的C1-C6烷基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{10}CO_2R^{11}$ 、 $-NR^{10}C(O)R^{11}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)NR^{10}R^{11}$ 、 $-SF_5$ 、氰基、硝基、卤素原子或氢原子,

[0026] R^5 和 R^6 彼此相同或不同,并且各自表示任选地具有一个或多个选自X组的原子或基团的C1-C6烷基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{10}CO_2R^{11}$ 、 $-NR^{10}C(O)R^{11}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)NR^{10}R^{11}$ 、 $-OC(O)R^{10}$ 、 $-SF_5$ 、氰基、硝基、卤素原子或氢原子(条件是: R^5 和 R^6 不同时表示氢原子),

[0027] R^7 表示任选地具有一个或多个选自W组的原子或基团的C1-C6烷基、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-CH_2CO_2R^{10}$ 、C3-C6环烷基或氢原子,

[0028] R^8 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C6烷基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、氰基、硝基、卤素原子或氢原子,

[0029] R^{10} 和 R^{11} 彼此相同或不同,并且各自表示任选地具有一个或多个选自X组的原子或基团的C1-C6烷基或氢原子(条件是:在 $-S(O)_mR^{10}$ 中,当m是1或2时, R^{10} 不表示氢原子),

[0030] m彼此独立地表示0、1或2,并且

[0031] n表示0、1或2,

[0032] X组:由任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C6烷氧基、任选地具有一个或多个卤素原子或者一个或多个C1-C3烷基的C3-C6环烷基、氰基、羟基和卤素原子组成的组,

[0033] W组:任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C6烷氧基、任选地具有一个或多个卤素原子的C3-C6环烷基、羟基、卤素原子或氰基],和

[0034] 2,4-二氧化-1-(5-嘧啶基甲基)-3-[3-(三氟甲基)苯基]-2H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐(triflumezopyrim)(下文中,称为“本发明的组合物”)。

[0035] [2]在[1]中所述的用于防治有害生物的组合,其中 A^1 表示 $-NMe-$ 、氧原子或硫原子, A^2 表示 $=N-$ 、 $=N(\rightarrow O)-$ 或 $=CH-$, R^1 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C6烷基, R^2 和 R^4 表示氢原子, R^3 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基或氢原子, R^5 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基、 $-OR^{10}$ 或 $-S(O)_mR^{10}$, R^6 表示 $-NR^{10}R^{11}$ 或氢原子,并且 R^{10} 和 R^{11} 彼此独立地表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基。

[0036] [3]在[1]或[2]中所述的用于防治有害生物的组合,其中 A^1 表示 $-NMe-$ 。

[0037] [4]在[1]或[2]中所述的用于防治有害生物的组合,其中 A^1 表示氧原子。

[0038] [5]在[1]至[4]任一项中所述的用于防治有害生物的组合,其中所述由式(1)表示的化合物与2,4-二氧化-1-(5-嘧啶基甲基)-3-[3-(三氟甲基)苯基]-2H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐的比率按重量计在100:1至1:100的范围内。

[0039] [6]在[1]至[4]任一项中所述的用于防治有害生物的组合,其中所述由式(1)表示的化合物与2,4-二氧化-1-(5-嘧啶基甲基)-3-[3-(三氟甲基)苯基]-2H-吡啶并[1,2-a]嘧啶鎓内盐的比率按重量计在10:1至1:10的范围内。

[0040] [7]一种用于防治有害生物的方法,所述方法包括向有害生物或有害生物生活的栖息地施用有效量的在[1]至[6]任一项中所述的用于防治有害生物的组合。

[0041] [8]一种用于防治有害生物的方法,所述方法包括向植物、植物种子、鳞茎或用于

栽培所述植物的土壤施用有效量的在[1]至[6]任一项中所述的用于防治有害生物的组合物。

[0042] [9]一种植物的种子或鳞茎,所述植物的种子或鳞茎附着了有效量的在[1]至[6]任一项中所述的用于防治有害生物的组合物。

[0043] [发明的效果]

[0044] 本发明可以防治有害生物。

具体实施方式

[0045] 本发明的用于防治有害生物的组合物包含以上提及的由式(1)表示的化合物(下文中,称为“本发明化合物”)和triflumezopyrim。

[0046] 如本文所述的基团解释如下。

[0047] 如本文使用的,表述“Ca-Cb烷基”表示具有“a”至“b”个碳原子的直链或支链烷基。

[0048] 表述“Ca-Cb卤代烷基”表示具有“a”至“b”个碳原子的直链或支链烷基,其中与碳原子连接的一个或多个氢原子被一个或多个卤素原子替代。当存在两个以上卤素原子时,所述卤素原子彼此可以相同或不同。

[0049] 表述“Ca-Cb烷氧基”表示具有“a”至“b”个碳原子的直链或支链烷基-O-基团。

[0050] 表述“Ca-Cb环烷基”表示具有“a”至“b”个碳原子的饱和环状烷基。

[0051] 如本文使用的,表述“任选地具有一个或多个选自X组的原子或基团”表示当存在两个以上原子或基团时,选自X组的原子或基团彼此可以相同或不同。

[0052] 如本文使用的,表述“任选地具有一个或多个选自W组的原子或基团”表示当存在两个以上选自W组的原子或基团时,所述原子或基团彼此可以相同或不同。

[0053] 如本文使用的,表述“任选地具有一个或多个卤素原子”表示当存在两个以上卤素原子时,所述卤素原子彼此可以相同或不同。

[0054] 在本发明化合物中,如本文使用的,术语“卤素原子”表示氟原子、氯原子、溴原子和碘原子。

[0055] 在本发明化合物中,表述“任选地具有一个或多个选自X组的原子或基团的C1-C6烷基”表示具有1至6个碳原子的直链或支链饱和烷基,其中与碳原子连接的氢原子可以任选地被选自X组的原子或基团替代。当存在两个以上原子或基团时,选自X组的原子或基团彼此可以相同或不同。

[0056] “任选地具有一个或多个选自X组的原子或基团的C1-C6烷基”的实例包括由以下各项组成的任选地具有一个或多个选自X组的原子或基团的C1-C6烷基:甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、戊基、新戊基、己基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、丙氧基甲基、异丙氧基甲基、丁氧基甲基、仲丁氧基甲基、叔丁氧基甲基、2-甲氧基乙基、2-乙氧基乙基、2-丙氧基乙基、2-异丙氧基乙基、2-丁氧基乙基、2-仲丁氧基乙基、2-叔丁氧基乙基、三氟甲基、三氯甲基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基和五氟乙基、2-羟基乙基、环丙基甲基、1-甲基环丙基甲基、2,2-二氟环丙基甲基、三甲氧基甲基、三乙氧基甲基等,其根据所指定的碳原子数进行选择。

[0057] 在本发明化合物中,表述“任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C6烷基”表示具有1至6个碳原子的直链或支链饱和烷基,其中与碳原子连接的氢原子可以任选地被卤素原

子替代,并且当存在两个以上卤素原子时,所述卤素原子彼此可以相同或不同。

[0058] “任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C6烷基”的实例包括选自以下各项的任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C6烷基:甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、戊基、新戊基、己基、三氟甲基、三氯甲基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基和五氟乙基或七氟异丙基等,其根据所指定的碳原子数进行选择。

[0059] 在本发明化合物中,“任选地具有一个或多个选自W组的原子或基团的C1-C6烷基”的实例包括由以下各项组成的任选地具有一个或多个选自W组的原子或基团的C2-C6烷基:甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、戊基、新戊基、己基、三氟甲基、三氯甲基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、五氟乙基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、丙氧基甲基、异丙氧基甲基、丁氧基甲基、仲丁氧基甲基、异丁氧基甲基、叔丁氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基乙基、丙氧基乙基、异丙氧基乙基、丁氧基乙基、仲丁氧基乙基、异丁氧基乙基、叔丁氧基乙基等。当存在两个以上选自W组的原子或基团时,所述选自W组的原子或基团彼此可以相同或不同。

[0060] 在本发明化合物中,“任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C6烷氧基”的实例包括甲氧基、三氟甲氧基、乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、丙氧基、异丙氧基、丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、戊氧基和己氧基。

[0061] 在本发明化合物中,“任选地具有一个或多个卤素原子的C3-C6环烷基”的实例包括环丙基、2,2-二氟环丙基、2,2-二氯环丙基、2,2-二溴环丙基、环丁基、环戊基和环己基。

[0062] 在本发明化合物中,“任选地具有一个或多个卤素原子或者一个或多个C1-C3烷基的C3-C6环烷基”的实例包括环丙基、1-甲基环丙基、2-甲基环丙基、1-氟环丙基、2,2-二氟环丙基、2,2-二氯环丙基、2,2-二溴环丙基、环丁基、环戊基和环己基。

[0063] 在本发明化合物中,表述“C1-C3卤代烷基”表示具有1至3个碳原子的直链或支链烃基,其中与碳原子连接的一个或多个氢原子被一个或多个卤素原子替代,并且当存在两个以上卤素原子时,所述卤素原子彼此可以相同或不同。

[0064] “C1-C3卤代烷基”的实例包括氟甲基、氯甲基、溴甲基、碘甲基、二氟甲基、二氯甲基、三氟甲基、氯二氟甲基、溴二氟甲基、三氯甲基、2-氟乙基、2-氯乙基、2-溴乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、五氟乙基、七氟丙基、七氟异丙基等。

[0065] 在本发明化合物中,“C1-C3烷基”的实例包括甲基、乙基、丙基和异丙基。

[0066] 在本发明化合物中,“C1-C3全氟烷基”的实例包括三氟甲基、五氟乙基、七氟丙基和七氟异丙基。

[0067] 在某一实施方案中,本发明化合物的实例包括如在以下[表1]至[表20]中所列的由式(1)表示的化合物。

[0068] [表1]

[0069]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
1	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
2	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
3	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
4	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N

5	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
6	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
7	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
8	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
9	Et	H	H	H	I	H	NMe	N	0	N
10	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	N	0	N
11	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	N	2	N
12	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	N	2	N
13	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	N	0	N
14	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	N	1	N
15	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	N	2	N
16	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
17	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
18	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
19	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
20	Et	H	H	H	S(O)CF ₃	H	NMe	N	2	N
21	Et	H	H	H	I	H	NMe	CH	0	N
22*	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	N(→0)	2	N
23	Et	H	H	H	SF ₅	H	NMe	CH	0	N
24	Et	H	H	H	SF ₅	H	NMe	CH	2	N
25	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N

[0070] [表2]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
26	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	0	N
27	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	2	N
28	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	N	0	N

[0071]

[0072]

29	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	N	1	N
30	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	0	N
31	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	1	N
32	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	2	N
33	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	0	N
34	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	1	N
35	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	2	N
36*	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N(→O)
37*	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N(→O)	2	N
38	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	0	N
39	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	1	N
40	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	2	N
41	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	N	0	N
42	Et	H	CF ₃	H	I	H	NMe	N	0	N
43	Et	H	CF ₃	H	SH	H	NMe	N	0	N
44	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	N	2	N
45	Et	H	CF ₃	H	I	H	NMe	CH	0	N
46	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CBr	2	N
47*	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	2	N(→O)
48*	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N(→O)	2	N
49	Et	H	H	H	OCF ₃	H	NMe	CH	0	N
50	Et	H	H	H	OCF ₃	H	NMe	CH	2	N

[0073] [表3]

[0074]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
51*	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N(→O)
52	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	0	N
53	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	2	N
54	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	CH	0	N
55	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	CH	2	N
56	Et	H	H	H	CF ₃	OMe	NMe	CH	2	N
57	Et	H	H	H	C(OH) ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
58	Et	H	H	H	C(OH) ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
59	Et	H	CF ₃	H	CO ₂ Me	H	NMe	N	0	N
60	Et	H	CF ₃	H	S(O)CF ₃	H	NMe	N	2	N
61	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	0	N
62	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	1	N
63	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	2	N
64	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	NMe	CH	2	N
65	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ CF ₃	N	0	N
66	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ CF ₃	N	0	N
67	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂	N	2	N

[0075]

							CF ₃			
68	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ CF ₃	N	2	N
69	Et	H	CF ₃	H	CO ₂ Me	H	NMe	N	2	N
70*	Et	H	CF ₃	H	CO ₂ Me	H	NMe	N(→O)	2	N
71	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
72	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
73	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
74	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
75	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CBr	0	N

[0076] [表4]

[0077]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
76	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	N	0	N
77	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	N	2	N
78	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NH	N	0	N
79	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NH	N	2	N
80	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	N	0	N
81	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	N	2	N
82	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	O	N	0	N
83	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	O	N	2	N
84	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	0	N
85	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	2	N
86	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	O	CH	0	N
87	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	O	CH	2	N
88	Et	H	H	H	CF ₃	Cl	NMe	N	2	N
89	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	Cl	NMe	N	2	N
90	Et	H	H	H	CF ₃	OC(O)Me	NMe	N	2	N
91	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	OC(O)Me	NMe	N	2	N
92	Et	H	H	H	CF ₃	OH	NMe	N	2	N
93	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	OH	NMe	N	2	N
94	Et	H	H	H	CF ₃	OMe	NMe	N	2	N
95	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	OMe	NMe	N	2	N
96	Et	H	H	H	CF ₃	SMe	NMe	N	2	N
97	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	SMe	NMe	N	2	N
98	Et	H	H	H	CF ₃	NMe ₂	NMe	N	2	N
99	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	NMe ₂	NMe	N	2	N
100	CH ₂ CycPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N

[0078] [表5]

[0079]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
101	CH ₂ Cyc Pr	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N

[0080]

102	CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
103	CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
104	CH ₂ CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
105	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
106	Et	Cl	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
107	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
108	Et	H	H	Cl	CF ₃	H	NMe	N	2	N
109	Et	H	OCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
110	Et	H	SCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
111	Et	H	S(O)CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
112	Et	H	S(O) ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
113	Et	H	CF(CF ₃) ₂ C F ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
114	Et	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
115	Et	H	Br	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
116	Et	H	I	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
117	Et	H	Me	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
118	Et	H	OMe	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
119	Et	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	H	NMe	N	2	N
120	Et	H	CF ₃	H	CF(CF ₃) ₂	H	NMe	N	2	N
121	Et	H	CF ₃	H	SF ₅	H	NMe	N	2	N
122	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
123	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
124	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
125	Et	H	CF ₃	H	SCF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N

[0081] [表6]

[0082]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
126	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
127	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
128	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OMe	N	2	N
129	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ OMe	N	2	N
130	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCN	2	N
131	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CCN	2	N
132	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CF	2	N
133	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CF	2	N
134	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CMe	2	N
135	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CMe	2	N
136	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	COMe	2	N
137	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	COMe	2	N
138	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CSCH ₂ CH ₃	2	N
139	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CSCH ₂ CH ₃	2	N
140	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CS(O) ₂ CH ₂ CH ₃	2	N
141	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CS(O) ₂ CH ₂ CH ₃	2	N

[0083]

142	Me	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
143	Me	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
144	Me	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
145	Pr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
146	Pr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
147	Pr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
148	iPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
149	iPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
150	iPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N

[0084] [表7]

[0085]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
151	tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
152	tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
153	tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
154	CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
155	CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
156	Et	H	H	H	CF ₃	H	NEt	N	0	N
157	Et	H	H	H	CF ₃	H	NEt	N	1	N
158	Et	H	H	H	CF ₃	H	NEt	N	2	N
159	Et	H	H	H	CF ₃	H	NPr	N	0	N
160	Et	H	H	H	CF ₃	H	NPr	N	1	N
161	Et	H	H	H	CF ₃	H	NPr	N	2	N

162	Et	H	H	H	CF ₃	H	NiPr	N	0	N
163	Et	H	H	H	CF ₃	H	NiPr	N	1	N
164	Et	H	H	H	CF ₃	H	NiPr	N	2	N
165	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCycPr	N	0	N
166	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCycPr	N	1	N
167	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCycPr	N	2	N
168	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	N	0	N
169	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	N	1	N
170	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	N	2	N
171	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OMe	N	0	N
172	Et	H	H	H	Me	H	NMe	N	0	N
173	Et	H	H	H	Me	H	NMe	N	1	N
174	Et	H	H	H	Me	H	NMe	N	2	N
175	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	0	N

[0086] [表8]

[0087]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
176	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	1	N
177	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	2	N
178	Et	H	H	H	I	H	NMe	N	1	N
179	Et	H	H	H	I	H	NMe	N	2	N

[0088]

180	Et	H	H	H	CN	H	NMe	N	0	N
181	Et	H	H	H	CN	H	NMe	N	1	N
182	Et	H	H	H	CN	H	NMe	N	2	N
183	Et	H	H	H	CHO	H	NMe	N	0	N
184	Et	H	H	H	CF ₂ H	H	NMe	N	0	N
185	Et	H	H	H	CF ₂ H	H	NMe	N	1	N
186	Et	H	H	H	CF ₂ H	H	NMe	N	2	N
187	Me	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	0	N
188	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCl	0	N
189	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCl	1	N
190	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCl	2	N
191	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CBr	1	N
192	Me	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	0	N
193	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	1	N
194	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	N	1	N
195	Me	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	0	N
196	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	1	N
197	Et	Cl	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
198	Et	Cl	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
199	Et	H	H	H	COCF ₃	H	NMe	N	0	N
200	Et	H	H	H	Cl	H	NMe	N	0	N

[0089] [表9]

[0090]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
201	Et	H	H	H	Cl	H	NMe	N	1	N
202	Et	H	H	H	Cl	H	NMe	N	2	N
203	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	0	N
204	Et	H	H	SEt	CF ₃	H	NMe	N	0	N
205	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	CH	0	N
206	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ CO ₂ Me	N	0	N
207	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ CO ₂ Et	N	0	N
208	Et	H	H	H	CF ₃	H	N(CH ₂) ₂ OMe	N	0	N
209	Et	H	H	H	CF ₃	H	NBu	N	0	N
210	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCO ₂ tBu	N	0	N
211	Et	H	H	H	CH(OH)CF ₃	H	NMe	N	0	N
212	Et	H	H	H	CHF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
213	Et	H	F	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
214	Et	H	F	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
215	Et	H	F	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
216	Et	OMe	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
217	Et	OMe	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
218	Et	H	OMe	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
219	Et	H	OMe	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
220	Et	H	OH	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N

[0091]

221	Et	H	H	H	NH ₂	H	NMe	N	0	N
222	Et	H	H	H	CHF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
223	Et	H	H	H	CHF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
224	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
225	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N

[0092] [表10]

[0093]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
226	Et	Cl	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
227	Et	Cl	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
228	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
229	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
230	Et	H	Cl	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
231	Et	H	H	Cl	CF ₃	H	NMe	N	0	N
232	Et	H	H	Cl	CF ₃	H	NMe	N	1	N
233	Et	H	H	OMe	CF ₃	H	NMe	N	0	N
234	Et	H	H	OMe	CF ₃	H	NMe	N	1	N
235	Et	H	H	OMe	CF ₃	H	NMe	N	2	N

236	Et	H	H	H	SH	H	NMe	N	0	N
237	Et	H	H	H	Et	H	NMe	N	0	N
238	Et	H	H	H	iPr	H	NMe	N	0	N
239	Et	H	H	H	NHEt	H	NMe	N	0	N
240	Et	H	H	H	NEt ₂	H	NMe	N	0	N
241	Et	H	H	H	tBu	H	NMe	N	0	N
242	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	N	0	N
243	Et	F	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
244	Et	F	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
245	Et	F	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
246	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	N	1	N
247	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	N	2	N
248	Et	H	H	H	NMe ₂	H	NMe	N	0	N
249	Et	H	H	H	NHCOMe	H	NMe	N	0	N
250	Et	H	H	H	CH ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N

[0094] [表11]

[0095]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
251	Et	H	H	H	NMeCOMe	H	NMe	N	0	N
252	Et	H	H	H	NH ₂	H	NMe	N	1	N
253	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
254	Et	H	H	H	NHCOCF ₃	H	NMe	N	0	N
255	Et	H	H	H	NHCOCF ₃	H	NMe	N	1	N
256	Et	H	H	H	NHCOCF ₃	H	NMe	N	2	N
257	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	N	1	N

[0096]

258	CH ₂ CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
259	CH ₂ CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
260	Et	Me	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
261	Et	Me	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
262	Et	Me	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
263	Et	H	Me	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
264	Et	H	Me	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
265	Et	H	H	CF ₃	CF ₃	H	NMe	N	0	N
266	Et	H	H	CF ₃	CF ₃	H	NMe	N	1	N
267	Et	H	H	CF ₃	CF ₃	H	NMe	N	2	N
268	Et	H	Br	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
269	Et	H	Br	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
270	Et	H	CN	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
271	Et	H	CN	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
272	Et	H	CN	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
273	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
274	Et	H	CHO	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
275	Et	H	H	H	SMe	H	NMe	N	0	N

[0097]

[表12]

[0098]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
276	Et	H	H	H	S(O) ₂ Me	H	NMe	N	2	N
277	Et	H	H	H	SEt	H	NMe	N	0	N
278	Et	H	H	H	S(O) ₂ Et	H	NMe	N	2	N
279	Et	H	H	H	S(O) ₂ iPr	H	NMe	N	2	N
280	Et	H	H	H	SCH ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
281	Et	H	H	H	S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
282	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
283	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
284	Et	H	H	H	SCF(CF ₃) ₂	H	NMe	N	0	N
285	Et	H	H	H	CH(OH)CF ₃	H	NMe	N	0	N
286	Et	H	H	H	CH(Cl)CF ₃	H	NMe	N	0	N
287	Et	H	H	H	OH	H	NMe	N	0	N
288	Et	H	H	H	OH	H	NMe	N	2	N
289	Et	H	H	H	OCF ₂ Br	H	NMe	N	2	N
290	Et	H	H	H	OCF ₃	H	NMe	N	2	N
291	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
292	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
293	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
294	Et	H	H	H	StBu	H	NMe	N	0	N
295	Et	H	H	H	S(O) ₂ tBu	H	NMe	N	2	N
296	Et	H	CF ₃	H	Br	H	NMe	N	0	N
297	Et	H	CF ₃	H	Br	H	NMe	N	1	N
298	Et	H	CF ₃	H	Br	H	NMe	N	2	N

[0099]	299	Et	H	I	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
	300	Et	H	NO ₂	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N

[0100] [表13]

[0101]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
301	Et	H	NO ₂	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
302	Et	H	NO ₂	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
303	Et	H	I	H	SCF ₃	H	NMe	N	2	N
304	Et	H	I	H	SO ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
305	Et	H	Br	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
306	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	S	N	0	N
307	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	S	N	2	N
308	Et	H	H	H	C(OH)(CF ₃) ₂	H	NMe	N	0	N
309	Et	H	H	H	C(Cl)(CF ₃) ₂	H	NMe	N	0	N
310	Et	H	H	H	C(Cl)(CF ₃) ₂	H	NMe	N	1	N
311	Et	H	H	H	C(Cl)(CF ₃) ₂	H	NMe	N	2	N
312	Et	H	Cl	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
313	Et	H	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	NMe	CH	0	N
314	Et	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	H	NMe	CH	0	N
315	Et	H	CF ₃	H	I	H	NMe	N	2	N
316	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	1	N
317	Et	H	H	H	SF ₅	H	NMe	CH	1	N
318	Et	H	CF ₃	H	SF ₅	H	NMe	CH	0	N
319	Et	H	CF ₃	H	SF ₅	H	NMe	CH	1	N
320	Et	H	Me	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
321	Et	H	Me	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
322	Et	H	Me	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
323	Et	H	H	H	I	H	S	N	0	N
324	Et	H	CF ₃	H	I	H	S	N	0	N
325	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	S	N	0	N

[0102] [表14]

[0103]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
326	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	S	N	0	N
327	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	S	N	2	N
328	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	S	N	2	N
329	Et	H	Et	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
330	Et	H	H	H	S(O) ₂ NMe ₂	H	NMe	N	1	N
331	Et	H	H	H	S(O) ₂ NMe ₂	H	NMe	N	2	N
332	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CNH ₂	0	N
333	Et	H	Br	H	SCF ₃	H	NMe	N	2	N
334	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CNMe ₂	0	N
335	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CNH ₂	0	N

[0104]

336	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CNMe ₂	0	N
337	Et	H	SF ₅	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
338	Et	H	SF ₅	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
339	Et	H	SF ₅	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
340	Et	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	H	NH	CH	0	N
341	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	0	N
342	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	1	N
343	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	2	N
344	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	0	N
345	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	N	1	N
346	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	CH	0	N
347	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NEt	N	2	N
348	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ CN	N	2	N
349	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	N	2	N
350	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NPr	N	2	N

[0105] [表15]

[0106]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
351	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	N(CH ₂) ₃ CH ₃	N	2	N
352	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ CO ₂ Me	N	2	N
353	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCO ₂ tBu	N	2	N
354	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCO ₂ Me	N	2	N
355	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCOMe	N	2	N
356	Et	H	OCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
357	Et	H	OCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
358	Et	H	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
359	Et	H	NH ₂	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
360	Et	H	NHCOCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
361	Et	H	iPr	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N

362	Et	H	CHO	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
363	Bu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
364	CH ₂ CN	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
365	CH ₂ tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
366	CH ₂ CH ₂ CN	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
367	CH ₂ CycBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
368	CF ₂ Br	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
369	Et	H	CF ₂ H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
370	Et	H	CH ₂ OH	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
371	Bu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
372	CH ₂ CN	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
373	CH ₂ tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
374	CH ₂ CH ₂ CN	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
375	CH ₂ CycBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N

[0107] [表16]

[0108]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
376	CF ₂ Br	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
377	Et	H	CH ₂ F	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
378	Et	H	H	H	H	CF ₃	S	N	0	N
379	Et	H	H	H	H	CF ₃	S	N	2	N
380	Et	H	OCF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
381	Et	H	OCF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
382	Et	H	OCF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
383	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CMe	0	N
384	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CMe	1	N
385	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CF	0	N
386	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CF	1	N
387	CH ₂ CycPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
388	CH ₂ CycPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
389	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CBr	0	N
390	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CSCH ₂ CH ₃	0	N
391	Et	H	OCF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	N	0	N
392	Et	H	OCF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	N	1	N
393	Et	H	OCF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	N	2	N
394	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CBr	1	N
395	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CBr	2	N
396	Et	H	H	H	COMe	H	NMe	N	0	N
397	Et	H	H	H	COMe	H	NMe	N	2	N
398	Et	H	H	H	CF ₃	CN	NMe	N	2	N
399	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	CN	NMe	N	2	N
400*	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N(→O)	2	N(→O)

[0109] [表17]

[0110]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
401*	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N(→O)	2	N(→O)
402	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	COMe	0	N
403	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CSCH ₃	0	N
404	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CS(O) ₂ CH ₃	2	N
405	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CSA(O) ₂ CH ₂ CF ₃	2	N
406	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCN	0	N
407	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	COOH	NMe	N	2	N
408	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	CONH ₂	NMe	N	2	N
409*	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N(→O)	2	N
410*	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N(→O)	2	N(→O)
411	Et	H	CF ₃	H	COOH	H	NMe	N	0	N
412	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCN	1	N

[0111]

413	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	CCF ₃	0	N
414	Et	H	C(OCH ₃) ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
415	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	CH	0	N
416	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	CH	2	N
417	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCF ₃	2	N
418	Me	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
419	Me	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
420	Pr	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
421	Pr	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
422	iPr	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
423	iPr	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
424	Bu	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
425	Bu	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N

[0112] [表18]

[0113]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
426	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
427	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
428	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
429	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
430	tBu	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
431	tBu	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
432	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
433	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
434	Et	H	CF ₃	H	CN	H	NMe	N	0	N
435	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCF ₃	0	N
436	Et	H	H	H	SCF ₃	H	O	N	0	N
437	Et	H	H	H	SCF ₃	H	O	N	1	N
438	Et	H	H	H	SCF ₃	H	O	N	2	N
439	Et	H	H	H	S(O)CF ₃	H	O	N	2	N
440	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	N	2	N
441	Et	H	H	H	SCF ₃	H	O	CH	0	N
442	Et	H	H	H	SCF ₃	H	O	CH	1	N
443	Et	H	H	H	SCF ₃	H	O	CH	2	N
444	Et	H	H	H	S(O)CF ₃	H	O	CH	2	N
445	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	CH	2	N
446	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	O	N	0	N
447	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	O	N	1	N
448	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	O	N	2	N

449	Et	H	CF ₃	H	S(O)CF ₃	H	0	N	2	N
450	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	0	N	2	N

[0114] [表19]

[0115]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
451	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	0	CH	0	N
452	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	0	CH	1	N
453	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	0	CH	2	N
454	Et	H	CF ₃	H	S(O)CF ₃	H	0	CH	2	N
455	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	0	CH	2	N
456*	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	0	N(→0)	2	N
457*	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	0	N(→0)	2	N
458*	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	0	N	2	N(→0)
459*	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	0	CH	2	N(→0)
460*	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	0	N	2	N(→0)
461*	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	0	CH	2	N(→0)
462	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	0	N	0	N
463	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	0	N	1	N
464	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	0	N	2	N
465	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	0	CH	0	N
466	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	0	CH	1	N
467	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	0	CH	2	N
468	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	0	N	0	N
469	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	0	N	1	N
470	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	0	N	2	N
471	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	0	CH	0	N
472	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	0	CH	1	N
473	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	0	CH	2	N
474	Et	H	H	H	S(O)CF ₃	H	0	N	0	N
475	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	0	N	0	N

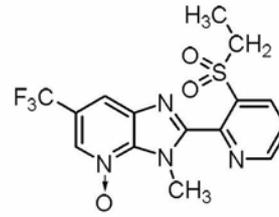
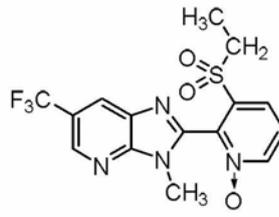
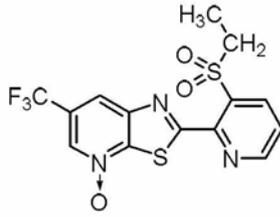
[0116] [表20]

[0117]

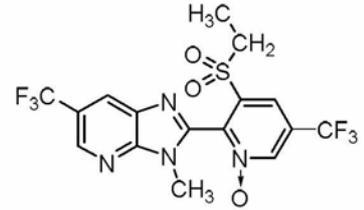
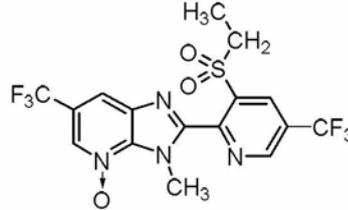
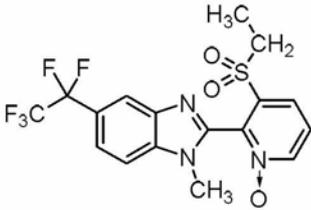
编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
476	Et	H	H	H	S(O)CF ₃	H	0	CH	0	N
477	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	0	CH	0	N
478	Et	H	CF ₃	H	S(O)CF ₃	H	0	N	0	N
479	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	0	N	0	N
480	Et	H	CF ₃	H	S(O)CF ₃	H	0	CH	0	N
481	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	0	CH	0	N

[0118] 在本文中,如在以上提及的[表1]至[表20]中所列出的在本发明化合物中的符号“*”表示N-氧化物。其具体实例包括以下。

[0119] 本发明化合物 22 本发明化合物 36 本发明化合物 37

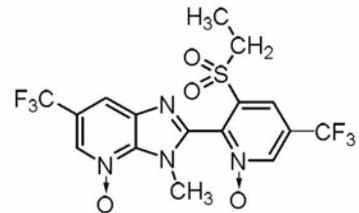
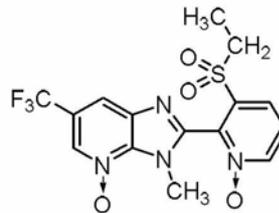
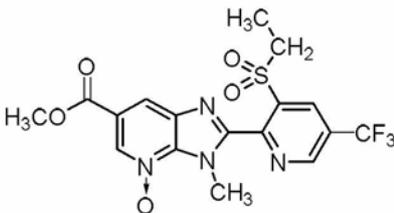


本发明化合物 47 本发明化合物 48 本发明化合物 51

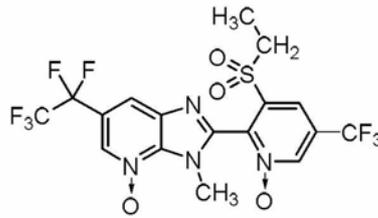
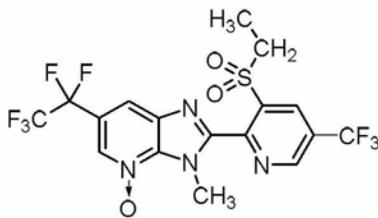


本发明化合物 70 本发明化合物 400 本发明化合物 401

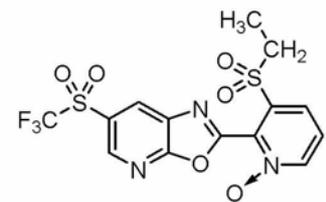
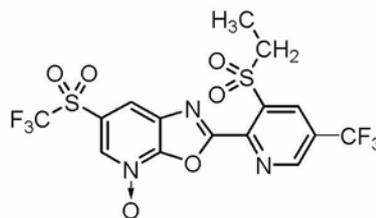
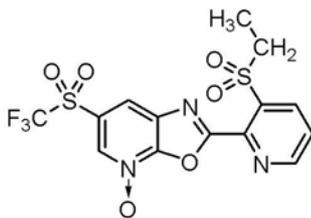
[0120]



本发明化合物 409 本发明化合物 410

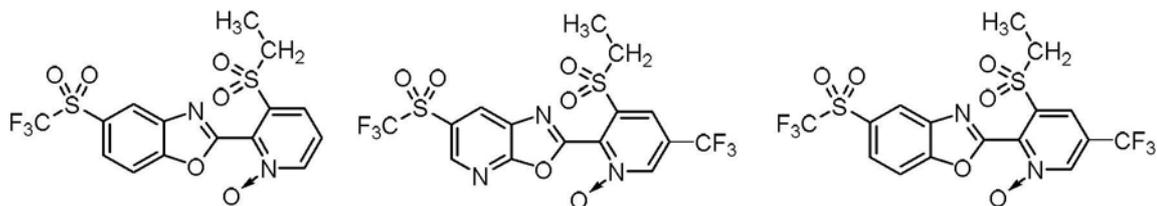


本发明化合物 456 本发明化合物 457 本发明化合物 458



[0121]

本发明化合物 459 本发明化合物 460 本发明化合物 461

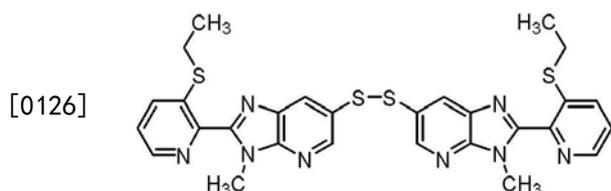


[0122] 在以上提及的[表1]至[表20]中,Me表示甲基,Et表示乙基,Pr表示丙基,Bu表示丁基,tBu表示叔丁基,iPr表示异丙基,CycPr表示环丙基,并且CycBu表示环丁基。

[0123] 这些化合物可以根据在WO 2013/018928小册子或WO 2014/104407小册子中所述的方法制备。关于它们之中的一些化合物,其制备方法在以下描述。

[0124] 制备例1 (1)

[0125] 将2-(3-乙硫基-吡啶-2-基)-6-碘-3-甲基-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶1.1g、碘化铜(1) 160mg、硫酸钠9水合物2.7g和N,N-二甲基甲酰胺(下文中,称为DMF) 10mL的混合物在110℃搅拌5小时。向反应混合物中加入水,并将混合物用乙酸乙酯萃取。有机层用硫酸钠干燥并在减压下浓缩。使残余物经过硅胶柱色谱,得到由以下提及的式表示的化合物:

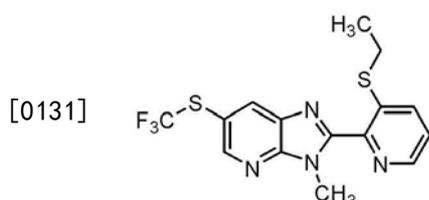


[0127] (下文中,称为化合物(1-1)) 710mg。

[0128] $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- D_6) δ : 8.56-8.55 (2H, m), 8.53-8.50 (2H, m), 8.38-8.36 (2H, m), 8.04 (2H, d), 7.61-7.56 (2H, m), 3.87 (6H, brs), 3.00 (4H, q), 1.23-1.16 (6H, m)。

[0129] 制备例1 (2)

[0130] 将化合物(1-1) 710mg和DMF 12mL的混合物冷却至-60℃,并向其中加入三氟碘甲烷10g。在-40℃,向混合物中逐滴加入四(二甲基氨基)乙烯1.2mL。将混合物温热至-10℃并在-10℃搅拌5小时。向反应混合物中加入水,并将混合物用乙酸乙酯萃取。有机层用硫酸钠干燥并在减压下浓缩。使残余物经过硅胶柱色谱,得到2-(3-乙硫基-吡啶-2-基)-3-甲基-6-三氟甲硫基-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶(下文中,称为“本发明化合物13”) 530mg。



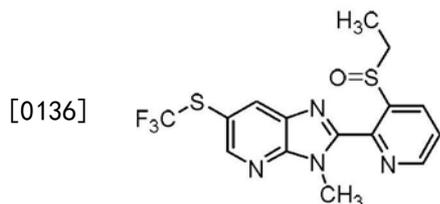
[0132] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$) δ : 8.67 (1H, d), 8.52 (1H, dd), 8.46 (1H, d), 7.79 (1H, dd), 7.39 (1H, dd), 4.03 (3H, s), 2.97 (2H, q), 1.36 (3H, t)。

[0133] 制备例2

[0134] 将本发明化合物13 200mg、间氯过苯甲酸(纯度65%以上) 230mg和氯仿10mL的混合物在冰冷却下搅拌5小时。向反应混合物中加入饱和碳酸氢钠水溶液并将混合物用氯仿

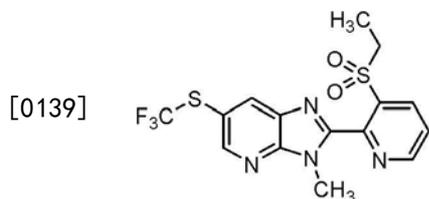
萃取。有机层用硫酸钠干燥并在减压下浓缩。使残余物经过硅胶柱色谱,得到2-(3-乙硫基-吡啶-2-基)-3-甲基-6-三氟甲硫基-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶(下文中,称为“本发明化合物14”)89mg和2-(3-乙基磺酰基-吡啶-2-基)-3-甲基-6-三氟甲硫基-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶(下文中,称为“本发明化合物15”)130mg。

[0135] 本发明化合物14



[0137] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.87-8.83 (1H, m), 8.73-8.64 (2H, m), 8.41 (1H, d), 7.72-7.66 (1H, m), 4.34 (3H, s), 3.72-3.62 (1H, m), 3.17-3.05 (1H, m), 1.47 (3H, t)。

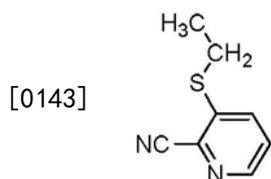
[0138] 本发明化合物15



[0140] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.01-8.98 (1H, m), 8.71 (1H, d), 8.55-8.52 (1H, m), 8.39 (1H, d), 7.72 (1H, dd), 3.90-3.81 (5H, m), 1.36 (3H, t)。

[0141] 制备例3(1)

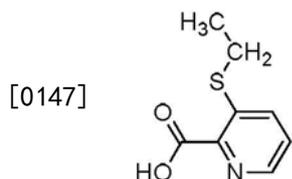
[0142] 在冰冷却下,向3-氯-2-氰基吡啶1.39g、乙硫醇0.9mL和DMF 10mL的混合物中加入氢化钠(60%,油状物料)0.52g,并将混合物在室温搅拌1小时。向反应混合物中加入水,并将混合物用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和碳酸氢钠水溶液和饱和盐水洗涤,并将混合物用无水硫酸钠干燥并在减压下浓缩。使所得的残余物经过硅胶柱色谱,得到2-氰基-3-乙硫基吡啶1.52g。



[0144] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.49 (1H, dd), 7.75 (1H, dd), 7.43 (1H, dd), 3.06 (2H, q), 1.38 (3H, t)。

[0145] 制备例3(2)

[0146] 向浓硫酸15mL和水5mL的混合物中加入2-氰基-3-乙硫基吡啶1.4g,并将混合物在130℃搅拌2小时。允许反应混合物冷却至室温,并向其中加入氢氧化钾水溶液,并将混合物用乙酸乙酯萃取。向所得的水层中加入浓盐酸,并将混合物用氯仿萃取并用无水硫酸钠干燥,然后在减压下浓缩,得到3-乙硫基吡啶甲酸1.15g。

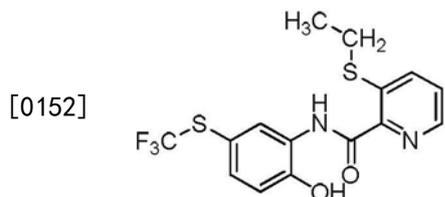


[0148] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.31 (1H, d), 7.75 (1H, d), 7.49 (1H, dd), 2.97 (2H, q), 1.44 (3H, t)。

[0149] 制备例3 (3)

[0150] 将2-氨基-4-(三氟甲硫基)苯酚(通过在W0 2009/131237小册子中所述的方法制备) 1.0g、3-乙硫基吡啶甲酸0.87g、1-乙基-3-(3-二甲氨基氨基丙基)碳二亚胺盐酸盐1.10g和氯仿10mL的混合物在室温搅拌30分钟。向反应混合物中加入水,并将混合物用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和碳酸氢钠水溶液和饱和盐水洗涤,并用无水硫酸镁干燥,并在减压下浓缩。使所得的残余物经过硅胶柱色谱,得到3-乙硫基-N-[2-羟基-5-(三氟甲硫基)苯基]吡啶酰胺(下文中,称为“化合物3-3”) 1.32g。

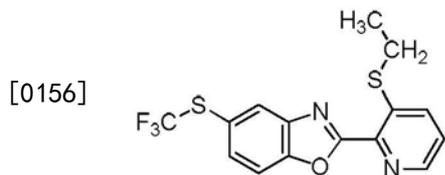
[0151] 化合物3-3



[0153] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 10.40 (1H, brs), 9.63 (1H, s), 8.36 (1H, dd), 7.75 (1H, dd), 7.53 (1H, d), 7.45 (1H, dd), 7.41 (1H, dd), 7.08 (1H, d), 2.97 (2H, q), 1.44 (3H, t)。

[0154] 制备例3 (4)

[0155] 将化合物3-3 1.23g、二-2-甲氧基乙基偶氮二甲酸酯1.28g、三苯基膦1.39g和四氢呋喃30mL的混合物在室温搅拌1小时并在50℃搅拌1小时。允许反应混合物冷却至室温,然后在减压下浓缩,并向其中加入水,并将混合物用乙酸乙酯萃取。有机层用饱和碳酸氢钠水溶液和饱和盐水洗涤,并用无水硫酸镁干燥并在减压下浓缩。使所得的残余物经过硅胶柱色谱,得到2-(3-乙硫基吡啶-2-基)-5-(三氟甲硫基)苯并噁唑(下文中,称为“本发明化合物441”) 1.21g。



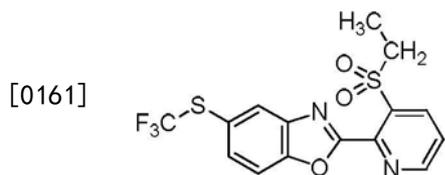
[0157] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.59 (1H, dd), 8.27 (1H, s), 7.78 (1H, dd), 7.75-7.69 (2H, m), 7.42 (1H, dd), 3.07 (2H, q), 1.47 (3H, t)。

[0158] 制备例4

[0159] 在冰冷却下,向本发明化合物441 (1.06g) 和氯仿30mL的混合物中加入间氯过苯甲酸(纯度65%以上) 1.47g,并将混合物在室温搅拌6小时。向反应混合物中加入10%亚硫酸钠水溶液,并将混合物用氯仿萃取。有机层用饱和碳酸氢钠水溶液洗涤,并用无水硫酸镁干燥,然后在减压下浓缩。使所得的残余物经过硅胶柱色谱,得到2-(3-乙基磺酰基吡啶-2-

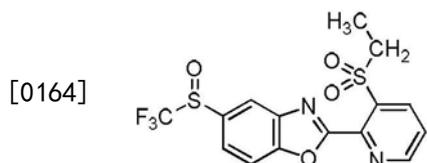
基)-5-(三氟甲磺基)苯并噁唑(下文中,称为“本发明化合物443”)0.87g和2-(3-乙基磺酰基吡啶-2-基)-5-(三氟甲基亚磺酰基)苯并噁唑(下文中,称为“本发明化合物444”)0.17g。

[0160] 本发明化合物443



[0162] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.03 (1H, dd), 8.60 (1H, dd), 8.19 (1H, d), 7.80–7.71 (3H, m), 4.02 (2H, q), 1.43 (3H, t)。

[0163] 本发明化合物444

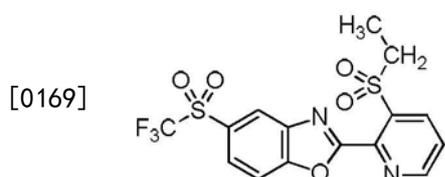


[0165] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.04 (1H, dd), 8.61 (1H, dd), 8.35 (1H, d), 7.96–7.86 (2H, m), 7.77 (1H, dd), 4.01 (2H, q), 1.44 (3H, t)。

[0166] 制备例5

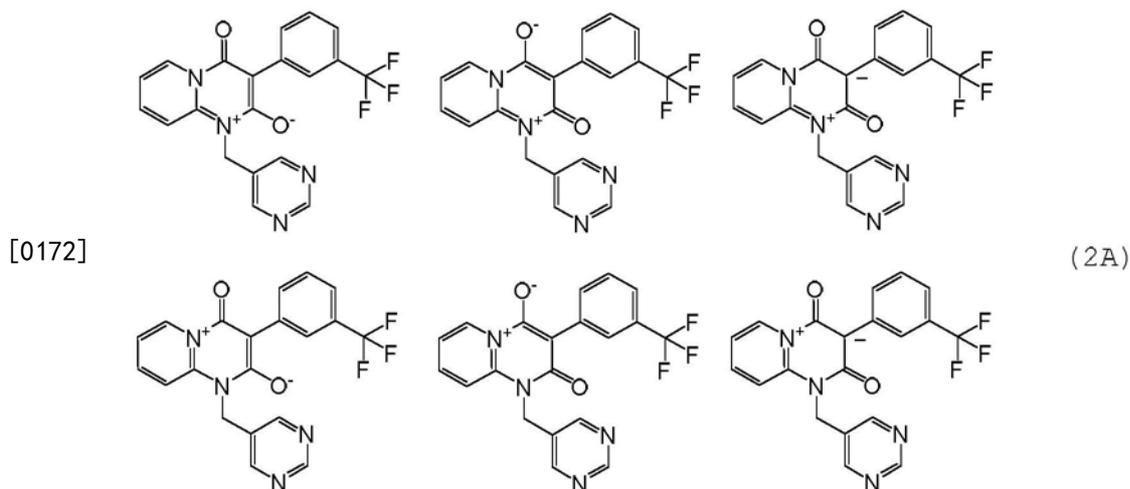
[0167] 在冰冷却下,向本发明化合物443 0.35g和氯仿8mL的混合物中加入间氯过苯甲酸(纯度65%以上)0.43g,并将混合物在40℃搅拌6小时。允许反应混合物冷却至室温,并向其中加入10%亚硫酸钠水溶液,并将混合物用氯仿萃取。有机层用饱和碳酸氢钠水溶液洗涤,并用无水硫酸镁干燥,然后在减压下浓缩。向所得的残余物中加入乙腈4mL、钨酸钠2水合物30mg和过氧化氢溶液(30%)4mL,并将混合物在80℃搅拌6小时。允许反应混合物冷却至室温,并向其中加入水,并通过过滤收集沉淀的固体,并向滤液中加入10%亚硫酸钠水溶液,并将混合物用乙酸乙酯萃取。有机层用水和饱和盐水洗涤,用无水硫酸镁干燥并在减压下浓缩。使所得的残余物经过硅胶柱色谱,得到2-(3-乙基磺酰基吡啶-2-基)-5-(三氟甲基磺酰基)苯并噁唑(下文中,称为“本发明化合物445”)0.35g。

[0168] 本发明化合物445



[0170] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.05 (1H, dd), 8.61 (1H, dd), 8.59 (1H, d), 8.17 (1H, dd), 7.96 (1H, d), 7.80 (1H, dd), 3.98 (2H, q), 1.45 (3H, t)。

[0171] 本发明中使用的Triflumezopyrim为介离子内盐的形式,并且通过以下六个结构式表示。



[0173] Triflumezopyrim可以根据在W0 2012/092115小册子中所述的方法制备,并且在该文献中,将其描述为2-羟基-4-氧代-1-(5-嘧啶基甲基)-3-[3-(三氟甲基)苯基]-4H-吡啶并[1,2-a]吡啶鎓分子内盐(intermolecular salt)。

[0174] 在某一实施方案中,本发明组合物的实例包括以下。

[0175] 一种用于防治有害生物的组合物,其包含由式(1)表示的化合物,其中 A^1 表示-NMe-、氧原子或硫原子, A^2 表示=N-、=N(\rightarrow O)-或=CH-, R^1 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C6烷基, R^2 和 R^4 各自表示氢原子, R^3 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基或氢原子, R^5 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基、-OR¹⁰或-S(O)_mR¹⁰, R^6 表示-NR¹⁰R¹¹或氢原子,并且R¹⁰和R¹¹彼此独立地表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基;和triflumezopyrim。

[0176] 一种用于防治有害生物的组合物,其包含由式(1)表示的化合物,其中 A^1 表示-NMe-或氧原子, A^2 表示=N-、=N(\rightarrow O)-或=CH-, R^1 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C6烷基, R^2 和 R^4 各自表示氢原子, R^3 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基或氢原子, R^5 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基、-OR¹⁰或-S(O)_mR¹⁰, R^6 表示-NR¹⁰R¹¹或氢原子,并且R¹⁰和R¹¹彼此独立地表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基;和triflumezopyrim。

[0177] 一种用于防治有害生物的组合物,其包含由式(1)表示的化合物,其中 A^1 表示-NMe-或氧原子, A^2 表示=N-、=N(\rightarrow O)-或=CH-, R^1 表示C1-C6烷基, R^2 、 R^4 和 R^6 各自表示氢原子, R^3 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基或卤素原子, R^5 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基、-OR¹⁰或-S(O)_mR¹⁰,并且R¹⁰表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基;和triflumezopyrim。

[0178] 一种用于防治有害生物的组合物,其包含由式(1)表示的化合物,其中 A^1 表示-NMe-, A^2 表示=N-或=N(\rightarrow O)-, R^1 表示C1-C6烷基, R^2 、 R^4 和 R^6 各自表示氢原子, R^3 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基或氢原子, R^5 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基或-S(O)_mR¹⁰,并且R¹⁰表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基;和triflumezopyrim。

[0179] 一种用于防治有害生物的组合物,其包含由式(1)表示的化合物,其中 A^1 表示氧原子, A^2 表示=N-、=N(\rightarrow O)-或=CH-, R^1 表示C1-C6烷基, R^2 、 R^4 和 R^6 各自表示氢原子, R^3 表示任

选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基或氢原子, R^5 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基、 $-OR^{10}$ 或 $S(O)_mR^{10}$, 并且 R^{10} 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基;和triflumezopyrim。

[0180] 一种用于防治有害生物的组合, 其包含由式(1)表示的化合物, 其中 A^1 表示氧原子, A^2 表示 $=N-$ 或 $=N(\rightarrow O)-$, R^1 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C6烷基, R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^6 各自表示氢原子, R^5 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基或 $-S(O)_mR^{10}$, 并且 R^{10} 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基;和triflumezopyrim。

[0181] 一种用于防治有害生物的组合, 其包含由式(1)表示的化合物, 其中 A^1 表示氧原子, A^2 表示 $=N-$, R^1 表示C1-C6烷基, R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^6 各自表示氢原子, R^5 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基或 $-S(O)_mR^{10}$, 并且 R^{10} 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基;和triflumezopyrim。

[0182] 一种用于防治有害生物的组合, 其包含由式(1)表示的化合物, 其中 A^1 表示氧原子, A^2 表示 $=CH-$, R^1 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C6烷基, R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^6 各自表示氢原子, R^5 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基或 $-S(O)_mR^{10}$, 并且 R^{10} 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基;和triflumezopyrim。

[0183] 一种用于防治有害生物的组合, 其包含由式(1)表示的化合物, 其中 A^1 表示氧原子, A^2 表示 $=CH-$, R^1 表示C1-C6烷基, R^2 、 R^3 、 R^4 和 R^6 各自表示氢原子, R^5 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基或 $-S(O)_mR^{10}$, 并且 R^{10} 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基;和triflumezopyrim。

[0184] 一种用于防治有害生物的组合, 其包含由式(1)表示的化合物, 其中 R^1 表示任选地具有一个或多个选自Y组的原子或基团的C1-C6烷基(Y组: 由任选地具有一个或多个卤素原子的C3-C6环烷基, 和卤素原子组成的组), R^2 和 R^4 各自表示氢原子, R^3 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基、 $-C(OR^{10})_3$ 、卤素原子或氢原子, R^5 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-SF_5$ 或卤素原子, R^6 表示 $-OR^{10}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-C(O)NR^{10}R^{11}$ 、 $-OC(O)R^{10}$ 、氰基、卤素原子或氢原子, R^7 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C6烷基、 $-CH_2CO_2R^{10}$ 、C3-C6环烷基或氢原子, R^8 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、氰基、卤素原子或氢原子, R^{10} 和 R^{11} 彼此独立地表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基或氢原子(条件是: 在 $-S(O)_mR^{10}$ 中, 当m是1或2时, R^{10} 不表示氢原子);和triflumezopyrim。

[0185] 一种用于防治有害生物的组合, 其包含由式(1)表示的化合物, 其中 R^1 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基, R^2 和 R^4 各自表示氢原子, R^3 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基、 $-C(OR^{10})_3$ 、卤素原子或氢原子, R^5 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 或卤素原子, R^6 表示氰基、 $-NR^{10}R^{11}$ 、卤素原子或氢原子, R^7 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C6烷基, R^8 表示 $-S(O)_mR^{10}$ 、氰基、卤素原子或氢原子, 并且 R^{10} 和 R^{11} 各自彼此独立地表示氰基、卤素原子或氢原子, 并且 R^{10} 和 R^{11} 各自彼此独立地表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基;和triflumezopyrim。

[0186] 一种用于防治有害生物的组合, 其包含由式(1)表示的化合物, 其中 R^1 表示乙基, R^2 和 R^4 各自表示氢原子, R^3 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基、 $-C(OR^{10})_3$ 、卤素原子或氢原子, R^5 表示C1-C3卤代烷基、 $-OR^{20}$ 、 $-S(O)_mR^{20}$ 或卤素原子(该 R^{20} 表示

C1-C3卤代烷基), R^6 表示氰基、 $-NR^{10}R^{11}$ 、卤素原子或氢原子, R^7 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C6烷基, R^8 表示 $-S(O)_mR^{10}$ 、氰基、卤素原子或氢原子, 并且 R^{10} 和 R^{11} 彼此独立地表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基; 和triflumezopyrim。

[0187] 一种用于防治有害生物的组合, 其包含由式(1)表示的化合物, 其中 A^1 表示 $-NR^7-$; 和triflumezopyrim。

[0188] 一种用于防治有害生物的组合, 其包含由式(1)表示的化合物, 其中 A^1 表示氧原子; 和triflumezopyrim。

[0189] 一种用于防治有害生物的组合, 其包含由式(1)表示的化合物, 其中 A^1 表示 $-NR^7-$, R^1 表示C1-C3烷基, R^2 和 R^4 各自表示氢原子, R^3 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基, R^3 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基、 $-C(OR^{10})_3$ 、卤素原子或氢原子, R^5 表示C1-C3卤代烷基、 $-OR^{20}$ 、 $-S(O)_mR^{20}$ 或卤素原子, R^6 表示氰基、 $-NR^{10}R^{11}$ 、卤素原子或氢原子, R^7 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C6烷基, R^8 表示 $-S(O)_mR^{10}$ 、氰基、卤素原子或氢原子, 并且 R^{10} 和 R^{11} 彼此独立地表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基, 并且 R^{20} 表示C1-C3卤代烷基; 和triflumezopyrim。

[0190] 一种用于防治有害生物的组合, 其包含由式(1)表示的化合物, 其中 A^1 表示氧原子, R^1 表示乙基, R^2 、 R^4 和 R^6 各自表示氢原子, R^3 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基、 $-C(OR^{10})_3$ 、卤素原子或氢原子, R^5 表示C1-C3卤代烷基、 $-OR^{20}$ 、 $-S(O)_mR^{20}$ 或卤素原子, R^8 表示 $-S(O)_mR^{10}$ 、氰基、卤素原子或氢原子, R^{10} 表示任选地具有一个或多个卤素原子的C1-C3烷基, 并且 R^{20} 表示C1-C3卤代烷基; 和triflumezopyrim。

[0191] 一种用于防治有害生物的组合, 其包含由式(1)表示的化合物, 其中 A^1 表示氧原子, R^1 表示乙基, R^2 、 R^4 和 R^6 各自表示氢原子, R^3 表示卤素原子或氢原子, R^5 表示C1-C3全氟烷基、 $-OR^{30}$ 或 $-S(O)_mR^{30}$, R^{30} 表示C1-C3全氟烷基, 并且 R^8 表示卤素原子或氢原子; 和triflumezopyrim。

[0192] 本发明的组合可以仅为本发明化合物与triflumezopyrim的混合物, 然而, 通常通过将本发明化合物和triflumezopyrim与惰性载体混合来制备, 并且如果需要, 添加表面活性剂和用于配制的其他辅助剂, 以配制成油溶液、乳油(emulsifiable concentrate)、可流动剂(flowables)、可湿性粉剂、粒状可湿性粉剂、粉状制剂(dust formulations)、颗粒剂等。

[0193] 而且, 以上配制的用于防治有害生物的组合可以以其自身或通过添加其他惰性成分使用。

[0194] 在本发明的组合中, 本发明化合物和triflumezopyrim的总量通常在0.1重量%至100重量%的范围内, 优选在0.2重量%至90重量%的范围内, 并且更优选在1至80重量%的范围内。

[0195] 制剂中使用的惰性载体的实例包括固体载体和液体载体。固体载体的实例包括以下各项的细粉和颗粒: 粘土(例如高岭土、硅藻土、膨润土、Fubasami粘土或酸性白土)、合成水合氧化硅、滑石、陶瓷、其他无机矿物(例如绢云母、石英、硫磺、活性炭、碳酸钙或水合二氧化硅)或化学肥料(例如, 硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、尿素或氯化铵)等; 以及合成树脂(例如, 聚酯树脂如聚丙烯、聚丙烯腈、聚甲基丙烯酸甲酯和聚对苯二甲酸乙二醇酯; 尼龙树脂(例如, 尼龙-6、尼龙-11和尼龙-66); 聚酰胺树脂; 聚氯乙烯、聚偏二氯乙烯、氯乙烯-丙烯共

聚物等等。

[0196] 液体载体的实例包括水、醇(例如,甲醇、乙醇、异丙醇、丁醇、己醇、苄醇、乙二醇、丙二醇或苯氧基乙醇);酮(例如,丙酮、甲乙酮或环己酮);芳族烃(例如,甲苯、二甲苯、乙苯、十二烷基苯、苯基二甲苯基乙烷或甲基萘);脂族烃(例如,己烷、环己烷、煤油或轻油);酯(例如,乙酸乙酯、乙酸丁酯、肉豆蔻酸异丙酯、油酸乙酯、己二酸二异丙酯、己二酸二异丁酯或丙二醇单甲醚乙酸酯);腈(例如乙腈或异丁腈);醚(例如,二异丙基醚、1,4-二噁烷、乙二醇二甲醚、二甘醇二甲醚、二丙二醇单甲醚或3-甲氧基-3-甲基-1-丁醇);酰胺(例如,N,N-二甲基甲酰胺或N,N-二甲基乙酰胺);卤代烃(例如,二氯甲烷、三氯乙烷或四氯化碳);亚砷(例如,二甲亚砷);碳酸丙烯酯;和植物油(例如,大豆油或棉籽油)。

[0197] 表面活性剂的实例包括非离子型表面活性剂如聚氧乙烯化烷基醚、聚氧乙烯化烷基芳基醚和聚乙二醇脂肪酸酯;和阴离子型表面活性剂如烷基磺酸盐、烷基苯磺酸盐和烷基硫酸盐。

[0198] 其他用于配制的辅助剂的实例包括粘合剂、分散剂、着色剂和稳定剂。具体实例包括酪蛋白、明胶、多糖(例如,淀粉、阿拉伯树胶、纤维素衍生物和海藻酸)、膨润土、水溶性合成聚合物(例如,聚乙烯醇、聚乙烯吡咯烷酮和聚丙烯酸)、PAP(酸式异丙基磷酸盐)、BHT(2,6-二-叔丁基-4-甲酚)、BHA(2-叔丁基-4-甲氧基苯酚和3-叔丁基-4-甲氧基苯酚的混合物)。

[0199] 本发明的用于防治有害生物的方法通过向有害生物或有害生物生活的栖息地、植物、土壤等施用有效量的本发明的组合物实施。在本发明的用于防治有害生物的方法中,本发明的组合物通常以对其配制本发明的组合物的用于防治有害生物的药剂形式施用。

[0200] 施用本发明的组合物的具体实例包括向茎干和叶、花、幼苗或穗(植物)施用;向种植植物之前的土壤或种植植物之后的土壤(用于栽培植物的土壤)施用;向植物种子(例如,种子消毒、种子浸泡或种子包覆)或鳞茎如种子块茎施用。而且,本发明化合物和triflumezopyrim可以单独施用,并且例如,将本发明化合物和triflumezopyrim中的任一种沉积至植物的种子或鳞茎,然后将另一种施用至该植物的所述种子或所述鳞茎,或者在种植之前或之后用于栽培该植物的所述种子或所述鳞茎的土壤。

[0201] 用于施用至植物的茎干和叶、花、幼苗、穗的方法的具体实例包括用于施用至植物的表面的方法如叶面施用和树干施用,以及用于在开花时(包括在开花之前、开花期间和开花之后)施用至花或整个植物的方法,和用于在谷物发芽季节施用至穗或整个植物的方法。

[0202] 而且,用施用至在种植植物之前或在种植植物之后的土壤(用于栽培植物的土壤)的方法的实例包括将本发明的组合物施用至待被保护免于损害如被有害生物吃食的作物的根部的方法,和通过将本发明的组合物从根和/或地下茎干吸收和转移到植物内部来防治吃食该植物的有害生物的方法。

[0203] 施用处理的具体实例包括对植穴的处理(喷雾到植穴中,在对植穴处理之后的土壤混合)、对植物底部的处理(对植物底部喷雾、在对植物底部处理之后的土壤混合、对植物底部的灌溉、在幼苗后期对植物底物的处理)、犁沟内处理(喷雾到犁沟中、在犁沟内处理之后的土壤混合)、对种植行的处理(对种植行喷雾、在对种植行处理之后的土壤混合、在生长期中对种植行喷雾)、在播种时对种植行的处理(在播种时对种植行喷雾、在播种时对种植行处理之后的土壤混合)、撒施处理(总体土壤表面喷雾、在撒施处理之后的土壤混合)、对

侧行 (lateral row) 的处理、水面的处理 (对水面的施用、在灌溉后对水面的施用)、其他土壤喷雾处理 (在生长期将颗粒剂在叶上喷雾、喷雾至树冠之下或在树主干周围、在土壤表面上喷雾、与表面土壤混合、喷雾至播种穴中、在犁沟的地面上喷雾、在植物之间喷雾)、其他灌溉处理 (土壤灌溉、在幼苗期灌溉、溶液注入、对刚好在地面上的植物部分灌溉、溶液滴加灌溉、化学灌溉)、育苗箱处理 (对育苗箱喷雾、育苗箱灌溉、用化学溶液灌溉到育苗箱中)、育苗盘处理 (对育苗盘喷雾、育苗盘灌溉、和用化学溶液灌溉到育苗盘中)、苗床处理 (对苗床喷雾、苗床灌溉、对灌溉后的秧床喷雾、浸泡幼苗)、苗床土壤掺入处理 (与苗床土壤混合、在播种前与苗床土壤混合、在播种时在用土壤覆盖前喷雾、与覆盖土壤混合, 以及其他处理 (与培养土壤混合、犁耕翻下 (plowing under)、与表面土壤混合、与雨滴落下的地方出的土壤混合、种植位置的处理、将颗粒剂喷雾到花簇上、与浆状肥料混合)。

[0204] 施用至植物的种子或鳞茎的实例也可以通过将本发明的组合物施用至该植物的种子或鳞茎实施。本文中所述的植物的种子表示处于在播种到土壤或用于栽培种子的培养基之前的状态的植物的种子, 并且本文中所述的鳞茎表示处于在种植到土壤或用于栽培的培养基中之前的状态的植物的盘状茎、球茎、根状茎、块茎、块茎状、种子块茎和块茎状根。用于通过将本发明的组合物施用到植物的种子或鳞茎中来防治有害生物的方法的实例包括将本发明的组合物直接施用到待保护免于损害如被有害生物摄取的植物的种子或鳞茎中的方法; 和通过将本发明的组合物使用在植物的种子或鳞茎附近来防治摄取种子的有害生物的方法; 和通过将本发明的组合物从植物的种子或鳞茎渗透入和转移到植物体的内部来防治摄取植物的有害生物的方法。将本发明的组合物施用至植物的种子或鳞茎的方法的实例包括喷雾处理、喷涂处理、浸泡处理、浸渍处理、涂覆处理、涂膜处理和颗粒涂覆处理。

[0205] 当本发明的组合物用于防治有害生物时, 施用剂量可以取决于施用时间、施用地点、施用方式等宽泛地改变。本发明化合物和 triflumezopyrim 的总量通常在 1 至 10,000g/10,000m² 的范围内。当本发明的组合物配制成乳油、可湿性粉剂、可流动制剂等时, 本发明化合物和 triflumezopyrim 通常通过用水稀释它们来施用, 以使本发明化合物和 triflumezopyrim 的总浓度在 0.01 至 10,000ppm 的范围内。在颗粒制剂或尘状制剂等情况下, 这些制剂通常按原样使用而无需将其稀释。

[0206] 而且, 当本发明的组合物施用至水稻时, 本发明的组合物可以通过育苗箱处理使用。通过育苗箱处理施用本发明的组合物的时间可以为从播种时间至移植时间。而且, 本发明的组合物可以用于水稻的直接播种栽培或移植栽培。当本发明的组合物对于水稻用于直接播种栽培时, 本发明的组合物可以在灌溉后的稻田上直接播种之前、在灌溉后的稻田上直接播种之后、在干稻田上直接播种之前或在干稻田上直接播种之后施用, 并且也可以是在播种之前至播种后 21 天的时间。当本发明的组合物对于水稻用于移植栽培时, 水稻可以是在移植之后, 并且施用的时间可以是移植之前至移植后 21 天的时间。

[0207] 本发明的组合物对其具有一些效力的有害生物的实例包括有害节肢动物如有害昆虫和有害螨虫。所述有害生物的具体实例包括以下。

[0208] 半翅目有害生物:

[0209] 飞虱科 (Delphacidae) (例如, 灰飞虱 (*Laodelphax striatellus*)、褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*) 或白背稻飞虱 (*Sogatella furcifera*)),

[0210] 角顶叶蝉科 (Deltocephalidae) (例如, 黑尾叶蝉 (*Nephotettix cincticeps*))、二

点黑尾叶蝉 (*Nephotettix virescens*)、茶绿叶蝉 (*Empoasca onukii*)，

[0211] 蚜科 (*Aphididae*) (例如,棉蚜 (*Aphis gossypii*)、桃蚜 (*Myzus persicae*)、甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*)、异绣线菊蚜 (*Aphis spiraecola*)、马铃薯长管蚜 (*Macrosiphum euphorbiae*)、土豆沟无网蚜 (*Aulacorthum solani*)、禾谷缢管蚜 (*Rhopalosiphum padi*)、褐橘声蚜 (*Toxoptera citricidus*)或梅大尾蚜 (*Hyalopterus pruni*))，

[0212] 蝽科 (*Pentatomidae*) (例如,花角绿蝽 (*Nezara antennata*)、豆蜂缘蝽 (*Riptortus clavatus*)、豆蜂缘蝽 (*Riptortus clavatus*)、中稻缘蝽 (*Leptocorisa chinensis*)、尖角二星蝽 (*Eysarcoris parvus*)或混茶翅蝽 (*Halyomorpha mista*))，

[0213] 粉虱科 (*Aleyrodidae*) (例如,温室粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*)、甘薯粉虱 (*Bemisia tabaci*)、柑橘粉虱 (*Dialeurodes citri*)、橘刺粉虱 (*Aleurocanthus spiniferus*))。

[0214] 鳞翅目 (*Lepidoptera*) 有害生物:

[0215] 螟蛾科 (*Pyralidae*) (例如,二化螟 (*Chilo suppressalis*)、三化螟 (*Tryporyza incertulas*)、稻纵卷叶野螟 (*Cnaphalocrocis medinalis*)、棉卷叶野螟 (*Notarcha derogata*)、印度谷斑螟 (*Plodia interpunctella*)、亚洲玉米螟 (*Ostrinia furnacalis*)、菜心野螟 (*Hellula undalis*)或蓝草螟蛾 (*Pediasia teterrellus*))，

[0216] 夜蛾科 (*Noctuidae*) (例如,斜纹贪夜蛾 (*Spodoptera litura*)、贪夜蛾 (*Spodoptera exigua*)、粘虫 (*Pseudaletia separata*)、甘蓝夜蛾 (*Mamestra brassicae*)、小地老虎 (*Agrotis ipsilon*)、黑点弧翅夜蛾 (*Plusia nigrisigna*)、粉夜蛾属 (*Trichoplusia* spp.)、实夜蛾属 (*Heliothis* spp.)或铃夜蛾属 (*Helicoverpa* spp.))，

[0217] 粉蝶科 (*Pieridae*) (例如,菜粉蝶 (*Pieris rapae*))，

[0218] 卷蛾科 (*Tortricidae*) (例如,梨小食心虫 (*Grapholita molesta*)、大豆食心虫 (*Leguminivora glycinivorella*)、日豆小卷蛾 (*Matsumuraeses azukivora*)、棉褐带卷蛾 (*Adoxophyes orana fasciata*)、茶小卷蛾 (*Adoxophyes honmai.*)、茶长卷蛾 (*Homona magnanima*)、苹果黄卷蛾 (*Archips fuscocupreanus*)或苹果皮小卷蛾 (*Cydia pomonella*))，

[0219] 细蛾科 (*Gracillariidae*) (例如,茶细蛾 (*Caloptilia theivora*)或金纹小潜细蛾 (*Phyllonorycter ringoneella*))，

[0220] 蛀果蛾科 (*Carposinidae*) (例如,桃柱果蛾 (*Carposina niponensis*))，

[0221] 潜蛾科 (*Lyonetiidae*) (例如,潜蛾属 (*Lyonetia* spp.))，

[0222] 毒蛾科 (*Lymantriidae*) (例如,毒蛾属 (*Lymantria* spp.)或黄毒蛾属 (*Euproctis* spp.))，

[0223] 巢蛾科 (*Yponomeutidae*) (例如,小菜蛾 (*Plutella xylostella*))，

[0224] 麦蛾科 (*Gelechiidae*) (例如,红铃麦蛾 (*Pectinophora gossypiella*)或马铃薯麦蛾 (*Phthorimaea operculella*))，

[0225] 灯蛾科 (*Arctiidae*) (例如,美国白蛾 (*Hyphantria cunea*))；

[0226] 谷蛾科 (*Tinea*) (例如,衣蛾 (*Tinea translucens*))。

[0227] 缨翅目 (*Thysanoptera*) 有害生物:

[0228] 缨翅科 (*Thysanopterae*) (例如,西花蓟马 (*Frankliniella occidentalis*)、南黄

蓟马(*Thrips parvi*)、茶黄硬蓟马(*Scirtothrips dorsalis*)、烟蓟马(*Thrips tabaci*)或丽花蓟马(*Frankliniella intonsa*)。

[0229] 双翅目(Diptera)有害生物:

[0230] 花蝇科(*Anthomyiidae*) (例如,灰地种蝇(*Delia platura*)或葱地种蝇(*Delia antiqua*)),

[0231] 潜蝇科(*Agromyzidae*) (例如,日本稻潜蛾(*Agromyza oryzae*)、大麦毛眼水蝇(*Hydrellia griseola*)、蔬菜斑潜蝇(*Liriomyza sativae*)、三叶草斑潜蝇(*Liriomyza trifolii*)或豌豆彩潜蝇(*Chromatomyia horticola*)),

[0232] 秆蝇科(*Chloropidae*) (例如,稻秆蝇(*Chlorops oryzae*)),

[0233] 实蝇科(*Tephritidae*) (例如,瓜寡鬃实蝇(*Dacus cucurbitae*)或地中海实蝇(*Ceratitis capitata*)),和

[0234] 果蝇科(*Drosophilidae*)。

[0235] 鞘翅目(*Coleoptera*)有害生物:

[0236] 叶甲科(*Chrysomelidae*) (例如,玉米根萤叶甲(*Diabrotica virgifera virgifera*)、黄瓜十一星叶甲(*Diabrotica undecimpunctata howardi*)),

[0237] 金龟科(*Scarabaeidae*) (例如,古铜异丽金龟(*Anomala cuprea*)、多色异丽金龟(*Anomala rufocuprea*)或日本弧丽金龟(*Popillia japonica*)),

[0238] 象甲科(*Curculionidae*) (例如,玉米象(*Sitophilus zeamais*)、稻水象(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、稻象甲(*Echinocnemus squameus*)、棉铃象甲(*Anthonomus grandis*)或猎象甲(*Sphenophorus venatus*)),

[0239] 拟步甲科(*Tenebrionidae*) (例如,黄粉虫(*Tenebrio molitor*)或赤拟谷盗(*Tribolium castaneum*)),

[0240] 叶甲科(*Chrysomelidae*) (例如,水稻负泥虫(*Oulema oryzae*)、黄守瓜(*Aulacophora femoralis*)、黄曲条跳甲(*Phyllotreta striolata*)或马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata*)),

[0241] 食植瓢虫属(*Epilachna*) (例如,茄二十八星瓢虫(*Epilachna vigintioctopunctata*)),

[0242] 小蠹科(*Scolytidae*) (例如,褐粉蠹(*Lyctus brunneus*)或纵坑切梢小蠹(*Tomicus piniperda*)),

[0243] 长蠹科(*Bostrichidae*),

[0244] 蛛甲科(*Ptinidae*),

[0245] 天牛科(*Cerambycidae*) (例如,白斑星天牛(*Anoplophora malasiaca*)),

[0246] 叩甲科(*Elateridae*) (叩甲属(*Agriotes* spp.)或金针虫(*Limonius* spp.)),和

[0247] 毒隐翅虫(*Paederus fuscipes*)。

[0248] 以上提及的有害生物还包括对于传统药剂获得抗性的有害生物种群,并且因此本发明的组合物对于该抗性种群是有效的。

[0249] 本发明组合物可以对其施用的植物的实例包括以下。

[0250] 作物:玉米、稻、小麦、大麦、黑麦、燕麦、高粱、棉花、大豆、花生、荞麦、甜菜、油菜籽、向日葵、甘蔗和烟草等;

[0251] 蔬菜：茄类蔬菜(茄子、西红柿、甜椒、辣椒和马铃薯等)、葫芦类蔬菜(黄瓜、南瓜、绿皮西葫芦、西瓜、甜瓜和南瓜等)、十字花科类蔬菜(日本萝卜、白萝卜、辣根、大头菜、大白菜、卷心菜、芥菜、椰菜和花椰菜等)、菊科类蔬菜(牛蒡、茼蒿、朝鲜蓟和莴苣等)、百合科类蔬菜(大葱、洋葱、大蒜和芦笋)、伞形科类蔬菜(胡萝卜、欧芹、旱芹和欧防风等)、藜科类蔬菜(菠菜和牛皮菜等)、唇形科类蔬菜(紫苏、薄荷和罗勒等)、草莓、甘薯、糯米山药和芋头等；

[0252] 开花植物；

[0253] 观叶植物；

[0254] 草坪草；

[0255] 果实：梨果类(苹果、梨、日本梨、木瓜和榲桲等)，核果类(桃、洋李、桃驳李、日本梅(*Prunus mume*)、樱桃、杏和李等)，柑果类(温州蜜柑、橘、柠檬、来檬和葡萄柚等)，坚果类(栗、胡桃、榛、杏仁、阿月浑子、腰果和澳洲坚果等)，浆果类(越橘、蔓越莓、黑莓和复盆子等)，葡萄，日本柿子，橄榄，枇杷(*Japanese plum*)，香蕉，咖啡，椰枣和椰子等；以及

[0256] 除果树外的其他树木：茶、桑、赏花植物、行道树(桤木、桦木、栎木、桉、银杏(*Ginkgo biloba*)、丁香、枫树、栎(*Quercus*)、杨、紫荆、枫香树(*Liquidambar formosana*)、悬铃木、榉树、日本香柏(*Thuja standishii*)、冷杉、日本铁杉、刺柏、松、云杉和紫杉(*Taxus cuspidate*)等。

[0257] 以上所述的植物可以是通过杂交技术繁殖的植物。

[0258] 即，通过杂交技术繁殖的植物是具有杂种优势的植物(通常，例如，其导致产量潜力的增强和对生物和非生物胁迫因素的抗性的改善)。

[0259] 前述“植物”可以包括已通过遗传重组赋予抗性的植物。

[0260] 例如，以上所述的植物还包括具有对除草剂具有抗性的植物，所述除草剂包括HPPD抑制剂如异噁唑草酮(*isoxaflutole*)；ALS抑制剂如咪唑乙烟酸(*imazethapyr*)和噻吩磺隆(*thifensulfuron methyl*)；EPSP抑制剂；谷氨酰胺合成酶抑制剂；溴苯腈(*bromoxynil*)；麦草畏(*dicamba*)等，所述抗性通过经典繁殖方法或遗传修饰技术赋予。

[0261] 以上所述的植物可以包括通过使用遗传修饰技术产生的，已经成为能够合成选择性毒素等(例如杆菌属)的植物。

[0262] 此外，以上所述的植物包括具有与如上述除草剂抗性、有害生物抗性、病害抗性等相关的两种以上类型的特征的品系(所述特征使用经典繁殖技术或遗传修饰技术赋予)，和具有两种以上类型的母系所拥有的性质的品系(所述性质通过将具有相同或不同类型性质的遗传修饰的植物杂交而赋予)。这样的植物的实例包括Smart stax(注册商标)。

[0263] 在本发明的组合中，本发明化合物与triflumezopyrim比率按重量计通常在100:1至1:100的范围内，并且优选在10:1至1:10的范围内。

[0264] 本发明的组合还可以包含一种或多种选自如以下提及的(A)组的化合物。

[0265] (A)组：由以下化合物组成的组：噻虫胺(*clothianidin*)、呋虫胺(*dinotefuran*)、噻虫嗪(*thiamethoxam*)、吡虫啉(*imidacloprid*)、烯啶虫胺(*nitenpyram*)、噻虫啉(*thiacloprid*)、氟虫腈(*fipronil*)、乙虫腈(*ethiprole*)、依芬普司(*etofenprox*)、氟硅菊酯(*silafaluofen*)、氯虫苯甲酰胺(*chlorantraniliprole*)、溴氰虫酰胺(*cyantraniliprole*)、杀螟丹(*cartap*)、氟吡呋喃酮(*flupyradifurone*)、吡蚜酮

(pymetrozine)、异噻菌胺(isotianil)、嘧菌酯(azoxystrobin)、肟醚菌胺(orysastrobin)、噻菌灵(probenazole)、噻酰菌胺(tiadinil)、三环唑(tricyclazole)、咯嗉酮(pyroquilon)、双氯氰菌胺(diclocymet)、嘧菌腈(ferimzone)、苯酞(phthalide)、春雷霉素盐酸盐水合物(kasugamycin hydrochloride hydrate)、tebufloquin、戊菌隆(pencycuron)、有效霉素(validamycin)、己唑醇(hexaconazole)、福多宁(flutolanil)、环丙酰菌胺(carpropamid)、氟吡菌胺(furametpyr)、氟唑菌苯(penflufen)和tolprocarb。

[0266] 组合的实例包括以下。

[0267] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim和异噻菌胺(isotianil)的组合；

[0268] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim和肟醚菌胺(orysastrobin)的组合；

[0269] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim和噻菌灵(probenazole)的组合；

[0270] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim和三环唑(tricyclazole)的组合；

[0271] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim和双氯氰菌胺(diclocymet)的组合；

[0272] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim和环丙酰菌胺(carpropamid)的组合；

[0273] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim和噻酰菌胺(tiadinil)的组合；

[0274] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim和咯嗉酮(pyroquilon)的组合；

[0275] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim和tolprocarb的组合；

[0276] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim和氟吡菌胺(furametpyr)的组合；

[0277] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim和氟唑菌苯胺(penflufen)的组合；

[0278] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim、异噻菌胺(isotianil)和氟吡菌胺(furametpyr)的组合；

[0279] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim、异噻菌胺(isotianil)和氟唑菌苯胺(penflufen)的组合；

[0280] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim、噻菌灵(probenazole)和氟吡菌胺(furametpyr)的组合；

[0281] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim、噻菌灵(probenazole)和氟唑菌苯胺(penflufen)的组合；

[0282] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim、三环唑(tricyclazole)和氟吡菌胺(furametpyr)的组合；

[0283] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim、三环唑(tricyclazole)和

氟唑菌苯胺 (penflufen) 的组合;

[0284] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim、噻酰菌胺 (tiadinil) 和氟吡菌胺 (furametpyr) 的组合;

[0285] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim、噻酰菌胺 (tiadinil) 和氟唑菌苯胺 (penflufen) 的组合;

[0286] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim、咯嗉酮 (pyroquilon) 和氟吡菌胺 (furametpyr) 的组合;

[0287] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim、咯嗉酮 (pyroquilon) 和氟唑菌苯胺 (penflufen) 的组合;

[0288] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim、tolprocarb和氟吡菌胺 (furametpyr) 的组合;

[0289] “本发明化合物1至481中的任一种”、triflumezopyrim、tolprocarb和氟唑菌苯胺 (penflufen) 的组合;

[0290] 实施例

[0291] 下文中,通过使用制剂例和试验例来更详细地解释本发明。然而,本发明不应局限于这些实施例。除非另有说明,“份”表示“重量份”。

[0292] 首先,描述制剂例。

[0293] 制剂例1

[0294] 将五 (5) 份的本发明化合物1至481中的任一种、10份的triflumezopyrim、35份的白炭黑和聚氧乙烯烷基醚硫酸铵盐 (重量比为1:1) 的混合物以及水混合以制得作为总重量份的100份,接着利用湿磨法细磨获得各个制剂。

[0295] 制剂例2

[0296] 将十 (10) 份的本发明化合物1至481中的任一种、2份的triflumezopyrim、1.5份的失水山梨醇三油酸酯、28份的含有2份聚乙烯醇的溶液混合并利用湿磨法研磨,然后向混合物中加入含有0.05份黄原胶的溶液和0.1份的硅酸镁铝,以制得作为总重量份的90份。向混合物中,加入10份的丙二醇,并将混合物搅拌和混合,获得各个制剂。

[0297] 制剂例3

[0298] 将十 (10) 份的本发明化合物1至481中的任一种、10份的triflumezopyrim、3份的木质素磺酸钙、2份的月桂基磺酸钠和剩余份的合成水合氧化硅良好研磨并混合,获得100份的各个可湿性粉剂。

[0299] 制剂例4

[0300] 加入一 (1) 份的本发明化合物1至481中的任一种、0.5份的triflumezopyrim、1份的合成水合氧化硅细粉、2份的木质素磺酸钙、30份的膨润土和剩余份的高岭粘土并混合。然后,向混合物中,加入适量的水,并将混合物搅拌,利用制粒机造粒并通过强迫通风干燥,获得100份的各个颗粒制剂。

[0301] 制剂例5

[0302] 将一百 (100) 份的2份本发明化合物1至481中的任一种、0.75份triflumezopyrim、2份异噻菌胺 (isotianil)、1份合成水合氧化硅、2份木质素磺酸钙、30份的膨润土和剩余份的高岭粘土的混合物充分研磨地混合,并向其中加入水,并将混合物很好捏合,并造粒和干

燥,获得100份的各个颗粒制剂。

[0303] 制剂例6至15

[0304] 除了使用在[表A]中所述的相应化合物及其用量代替2份的异噻菌胺(isotianil),根据制剂例5的类似程序获得各个颗粒制剂。

[0305] [表A]

制剂例	化合物	用量 [份]	
[0306]	6	异噻菌胺(isotianil)	2
		氟吡菌胺(furametpyr)	4
[0307]	7	异噻菌胺(isotianil)	2
		氟唑菌苯胺(penflufen)	2
	8	噻菌灵(probenazole)	10
	9	噻菌灵(probenazole)	24
	10	噻酰菌胺(tiadinil)	12
	11	三环唑(tricyclazole)	4
	12	肟醚菌胺(orysastrobin)	7
	13	咯嗉酮(pyroquilon)	12
	14	tolprocarb	4
	15	tolprocarb	9

[0308] 接下来,描述本发明的组合物至植物种子的应用例。

[0309] 应用例1

[0310] 通过使用旋转式种子处理机(拌种机(seed dresser),由Hans-Ulrich Hege GmbH制造),将根据制剂例1或2中所述的方法制备的各个制剂以200ml/100kg干燥高粱种子的量用于涂抹处理,获得经处理的各个种子。

[0311] 而且,向在以上提及的制剂中获得的各个制剂200mL中加入解草腈(oxabetrinil) 180g或肟草安(fluxofenim) 40g,并且所得的制剂可以用于在上述干燥的高粱种子中的涂抹处理,获得经处理的各个种子。

[0312] 应用例2

[0313] 通过使用旋转式种子处理机(拌种机(seed dresser),由Hans-Ulrich Hege GmbH制造),将根据制剂例1或2中所述的方法制备的各个制剂以40ml/10kg干燥玉米种子的量用于涂抹处理,获得经处理的各个种子。

[0314] 应用例3

[0315] 将根据制剂例3中所述的方法制备的各个可湿性粉剂以50g/10kg干燥玉米种子的量用于粉剂涂覆处理,获得经处理的各个种子。

[0316] 应用例4

[0317] 通过使用旋转式种子处理机(拌种机(seed dresser),由Hans-Ulrich Hege GmbH制造),将根据制剂例1或2中所述的方法制备的各个制剂以20ml/10kg干燥大豆种子的量用于涂抹处理,获得经处理的各个种子。

[0318] 应用例5

[0319] 通过使用旋转式种子处理机(拌种机(seed dresser),由Hans-Ulrich Hege GmbH制造),将根据制剂例3中所述的方法制备的各个可湿性粉剂以30g/10kg干燥大豆种子的量用于粉剂涂覆处理,获得经处理的各个种子。

[0320] 应用例6

[0321] 通过使用旋转式种子处理机(拌种机(seed dresser),由Hans-Ulrich Hege GmbH制造),将根据制剂例1或2中所述的方法制备的各个制剂以50ml/10kg干燥棉花种子的量用于涂抹处理,获得经处理的各个种子。

[0322] 应用例7

[0323] 通过使用旋转式种子处理机(拌种机(seed dresser),由Hans-Ulrich Hege GmbH制造),将根据制剂例1或2中所述的方法制备的各个制剂以150ml/10kg干燥葡萄种子的量用于涂抹处理,获得经处理的各个种子。

[0324] 应用例8

[0325] 通过使用旋转式种子处理机(拌种机(seed dresser),由Hans-Ulrich Hege GmbH制造),将根据制剂例1或2中所述的方法制备的各个制剂以20ml/10kg干燥水稻种子的量用于涂抹处理,获得经处理的各个种子。

[0326] 应用例9

[0327] 通过使用旋转式种子处理机(拌种机(seed dresser),由Hans-Ulrich Hege GmbH制造),将根据制剂例3中所述的方法制备的各个可湿性粉剂以60g/10kg干燥水稻种子的量用于粉剂涂覆处理,获得经处理的各个种子。

[0328] 接下来,通过以下试验例显示本发明的效果。

[0329] 试验例1

[0330] 分别将各个1mg的本发明化合物3、15、19、20、48、50、72、81、85、99、130、421、444、445、464和467或triflumezopyrim溶解到10 μ L的二甲苯、二甲基甲酰胺和表面活性剂(商品名:Sorpol 3005X,由TOHO CHEMICAL INDUSTRY CO.LTD制造)(4:4:1(体积比))的混合溶液中。向其中加入含有0.02% (v/v)的铺展剂(商品名:Sindain,由住友化学株式会社(Sumitomo Chemical Company,Limited)制造)的水,以制得如[表21]至[表22]中指示的各个规定浓度,从而制备各个测试化学溶液。

[0331] 将黄瓜(Cucumis sativus)的子叶的叶盘(长度1.5cm)放入24孔板(由Becton Dickinson制造)的各个孔中并且每1个孔释放2只棉蚜(Aphis gossypii)的无翅成虫和8只棉蚜幼虫,并以20 μ L/1个孔的比率喷雾试验化学溶液,将其称为处理组。

[0332] 而代替试验化学溶液,将20 μ L含有0.02% (v/v)的铺展剂(商品名:Sindain,由住友化学株式会社制造)的水喷雾到孔中,将其称为未处理组。

[0333] 在空气干燥之后,将微板的上部用透气性薄膜片(产品名:AeraSeal,由Excel Scientific Inc.制造)覆盖,并在昆虫释放后5天,考察各个孔的存活昆虫的数量。

[0334] 分别地,对于处理组或未处理组的各个防治值,通过以下公式计算。

[0335] 公式(1)

[0336] 防治值(%) = $\{1 - (T_{ai}) / (C_{ai})\} \times 100$

[0337] 其中该公式中的符号代表以下描述。

[0338] C_{ai} :未处理组中在考察时存活昆虫的数量;

[0339] Tai:处理组中在考察时存活昆虫的数量;

[0340] 作为结果,如[表21]至[表22]中所显示的,分别包含本发明化合物3、15、19、20、48、50、72、81、85、99、130、421、444、445、464和467以及triflumezopyrim的本发明的组合物显示优异的防治效力。

[0341] 这里,分别地,在类似于上述实验进行的试验中观察到的triflumezopyrim或本发明化合物单独的各个防治值在以下显示。对于triflumezopyrim,4 (浓度0.1ppm) 和30 (浓度1ppm);对于本发明化合物15、28 (浓度1ppm);对于本发明化合物20、12 (浓度0.01ppm);对于本发明化合物72、32 (浓度10ppm);对于本发明化合物444、32 (浓度1ppm);对于本发明化合物445、30 (浓度0.1ppm) 和37 (浓度1ppm)。

[0342] [表21]

试验化合物	浓度(ppm)	观察的防治值
本发明化合物 3 + triflumezopyrim	1 + 1	84
本发明化合物 15 + triflumezopyrim	1 + 1	100
本发明化合物 15 + triflumezopyrim	1 + 0.1	100
本发明化合物 19 + triflumezopyrim	0.01 + 1	92
本发明化合物 20 + triflumezopyrim	0.01 + 1	84
本发明化合物 48 + triflumezopyrim	0.1 + 1	80
本发明化合物 50 + triflumezopyrim	10 + 1	80
本发明化合物 50 + triflumezopyrim	1 + 1	76
本发明化合物 72 + triflumezopyrim	10 + 1	100
本发明化合物 72 + triflumezopyrim	10 + 0.1	100

[0344] [表22]

试验化合物	浓度(ppm)	观察的防治值
本发明化合物 81 + triflumezopyrim	10 + 1	100
本发明化合物 81 + triflumezopyrim	1 + 1	92
本发明化合物 81 + triflumezopyrim	0.1 + 1	64
本发明化合物 85 + triflumezopyrim	10 + 1	100
本发明化合物 85 + triflumezopyrim	1 + 1	68
本发明化合物 99 + triflumezopyrim	10 + 0.1	92
本发明化合物 99 + triflumezopyrim	1 + 1	100
本发明化合物 130 + triflumezopyrim	10 + 0.1	52
本发明化合物 421 + triflumezopyrim	0.1 + 1	92
triflumezopyrim		
本发明化合物 444 + triflumezopyrim	1 + 1	88
本发明化合物 444 + triflumezopyrim	1 + 0.1	60
本发明化合物 445 + triflumezopyrim	1 + 0.1	73
本发明化合物 445 + triflumezopyrim	0.1 + 1	80
本发明化合物 445 + triflumezopyrim	1 + 1	100
本发明化合物 464 + triflumezopyrim	0.01 + 1	64
本发明化合物 467 + triflumezopyrim	0.1 + 1	84
本发明化合物 467 + triflumezopyrim	0.01 + 1	72

[0347] 工业实用性

[0348] 本发明可以防治有害生物。