



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 115996640 A

(43) 申请公布日 2023. 04. 21

(21) 申请号 202180044710.2

(22) 申请日 2021.06.22

(30) 优先权数据

63/042,812 2020.06.23 US

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2022.12.22

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/US2021/038332 2021.06.22

(87) PCT国际申请的公布数据

W02021/262621 EN 2021.12.30

(71) 申请人 FMC公司

地址 美国宾夕法尼亚

(72) 发明人 张文明

(74) 专利代理机构 永新专利商标代理有限公司

72002

专利代理师 王世娜

(51) Int. Cl.

A01N 43/80 (2006.01)

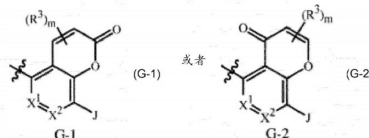
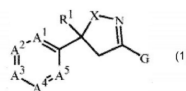
权利要求书7页 说明书112页

(54) 发明名称

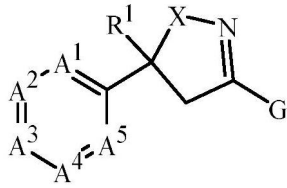
用于防治无脊椎有害生物的色烯酮化合物

(57) 摘要

披露了式1的化合物(包括所有几何异构体和立体异构体)、其N-氧化物和盐,其中G是以下结构并且A¹、A²、A³、A⁴、A⁵、R¹、R³、m、X、X¹、X²和J是如本披露中所定义的。还披露了含有这些式1的化合物的组合物,以及用于防治无脊椎有害生物的方法,这些方法包括使该无脊椎有害生物或其环境与生物学有效量的本披露的化合物或组合物接触。披露了式1的化合物(包括所有几何异构体和立体异构体)、其N-氧化物和盐, (I), 其中G是(G-1)或(G-2), 并且A¹、A²、A³、A⁴、A⁵、R¹、R³、m、X、X¹、X²和J是如本披露中所定义的。还披露了含有这些式1的化合物的组合物, 以及用于防治无脊椎有害生物的方法, 这些方法包括使该无脊椎有害生物或其环境与生物学有效量的本披露的化合物或组合物接触。



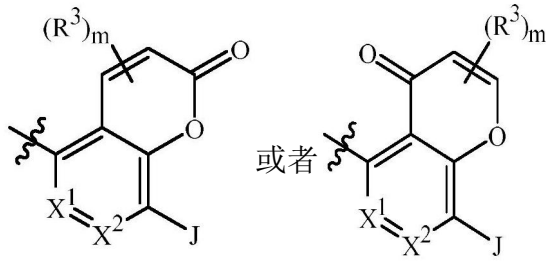
1. 一种选自式1、其N-氧化物和盐的化合物，



1

其中

G是



G-1

G-2

A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 和 A^5 各自独立地是N或 CR^2 ，前提是 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 和 A^5 中不超过一个是N；

X是O、S或 CH_2 ；

X^1 和 X^2 各自独立地是N或 CR^3 ；

R^1 是 C_1 - C_2 卤代烷基；

每个 R^2 独立地是H、卤素、-CN、-NO₂、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 卤代烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 烷基磺酰基或 C_1 - C_4 卤代烷基磺酰基；

每个 R^3 独立地是H、卤素、-CN、-NO₂、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 卤代烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 烷基磺酰基或 C_1 - C_4 卤代烷基磺酰基；

m是0、1或2；

J是 $C(=Z)NR^4R^5$ 或 $CH(R^6)N(R^3)C(=Z)R^{14}$ ；

每个Z独立地是O或S；

R^4 是H、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_7 烷基环烷基、 C_4 - C_7 环烷基烷基、 C_2 - C_7 烷基羰基或 C_2 - C_7 烷氧基羰基；

R^5 是H、OR¹⁰、NR¹¹R¹²、SO₂NR¹¹R¹²、 $C(R^{12})=NOR^{11}$ 、CHR¹²NHR¹¹或Q¹；或 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_7 烷基环烷基或 C_4 - C_7 环烷基烷基，各自任选地被一个或多个独立地选自R⁷的取代基取代；或者

R^4 和 R^5 连同它们所附接的氮一起形成3元至6元环，该环含有选自碳原子和最高达一个独立地选自氮、硫和氧的另外原子的环成员，其中该硫原子环成员选自S、S(=O)和S(=O)₂，所述环任选地被1至4个独立地选自以下各项的取代基取代：卤素、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷基、 C_1 - C_2 烷氧基、 C_1 - C_2 卤代烷氧基、-CN和-NO₂；

R^6 是H、卤素、-CN、 C_1 - C_3 烷基或 C_1 - C_3 卤代烷基；

每个 R^7 独立地是卤素、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基、 C_1 - C_6 烷基氨基、 C_2 - C_8 二烷基氨基、 C_3 - C_6 环烷基氨基、 C_2 - C_7 烷基羰基、 C_2 - C_7 烷氧基羰基、 C_2 - C_7 烷基氨基羰基、 C_3 - C_7 环烷基氨基羰基、 C_3 - C_7 烯基氨基羰基、 C_3 - C_7 炔基氨基羰基、 C_3 - C_9 二烷基氨基羰基、 C_2 - C_7 卤代烷基羰基、 C_2 - C_7 卤代烷氧基羰基、 C_2 - C_7 卤代烷基氨基羰基、 C_3 - C_9 卤代二烷基氨基羰基、羟基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 或 Q^2 ；

Q^1 是5元或6元芳族环或4元至11元部分不饱和环或环体系，其任选地含有最高达三个选自最高达1个氧、最高达1个硫和最高达3个氮的杂原子，其中最高达2个碳原子环成员独立地选自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ 并且该硫原子环成员选自 S 、 $S(=O)$ 和 $S(=O)_2$ ，每个环或环体系任选地被一个或多个独立地选自 R^8 的取代基取代；

每个 Q^2 独立地是苯环、5元或6元芳族杂环或3元至6元非芳族杂环，每个环任选地被一个或多个独立地选自 R^9 的取代基取代；

每个 R^8 独立地是卤素、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_3 - C_6 卤代环烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 卤代烷硫基、 C_1 - C_6 烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基、 C_1 - C_6 卤代烷基磺酰基、 C_1 - C_6 烷基氨基、 C_2 - C_6 二烷基氨基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_2 - C_7 烷基氨基羰基、 C_3 - C_9 二烷基氨基羰基、 $-CN$ 或 $-NO_2$ ；

每个 R^9 独立地是卤素、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_3 - C_6 卤代环烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 卤代烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 卤代烷硫基、 C_1 - C_6 烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基、 C_1 - C_6 卤代烷基磺酰基、 C_1 - C_6 烷基氨基、 C_2 - C_6 二烷基氨基、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、苯基或吡啶基；

R^{10} 是 H ；或 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_7 烷基环烷基或 C_4 - C_7 环烷基烷基，各自任选地被一个或多个卤素取代；

R^{11} 是 H 、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_7 烷基环烷基、 C_4 - C_7 环烷基烷基、 C_2 - C_7 烷基羰基、 C_2 - C_7 卤代烷基羰基或 C_2 - C_7 烷氧基羰基；

R^{12} 是 H 或 Q^3 ；或 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_7 烷基环烷基或 C_4 - C_7 环烷基烷基，各自任选地被一个或多个独立地选自 R^7 的取代基取代；或者

R^{11} 和 R^{12} 连同它们所附接的氮一起形成3元至6元环，该环含有选自碳原子和最高达一个独立地选自氮、硫和氧的另外原子的环成员，其中该硫原子环成员选自 S 、 $S(=O)$ 和 $S(=O)_2$ ，所述环任选地被1至4个独立地选自以下各项的取代基取代：卤素、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷基、 C_1 - C_2 烷氧基、 C_1 - C_2 卤代烷氧基、 $-CN$ 和 $-NO_2$ ；

Q^3 是苯环或5元或6元杂环，每个环任选地被一个或多个独立地选自 R^9 的取代基取代；

R^{13} 是 H 、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_7 烷基羰基、 C_2 - C_4 卤代烷基羰基、 C_2 - C_7 烷氧基羰基或 C_2 - C_4 烷氧基烷基；

R^{14} 是任选地被卤素、 OR^{19} 、 $S(=O)_nR^{20}$ 或 $NR^{21}C(=O)R^{22}$ 取代的 C_1 - C_6 烷基；或者

R^{14} 是 C_3 - C_6 环烷基或 C_4 - C_7 环烷基烷基，各自任选地被最高达一个环丙基和最高达4个选自卤素、 $-CN$ 、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 卤代烷基的取代基取代；或者

R^{14} 是 $(CH_2)_pQ^4$ ；或者

R^{14} 是 OR^{16} 或 $NR^{17a}R^{17b}$ ；

Q^4 是3元至6元饱和杂环，其含有选自碳原子和一个独立地选自一个氧和一个硫的杂原子的环成员，其中该硫原子环成员选自 S 、 $S(=O)$ 或 $S(=O)_2$ ，每个环任选地被最高达2个独

立地选自R¹⁸的取代基取代；

R¹⁶是C₁-C₄烷基或C₁-C₄卤代烷基；

R^{17a}是H、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基或C₃-C₆环烷基；

R^{17b}是H、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基或C₃-C₆环烷基；

R^{17a}和R^{17b}连同它们所附接的氮一起形成3元至6元环，该环含有选自碳原子和最高达一个独立地选自氮、硫和氧的另外原子的环成员，其中该硫原子环成员选自S、S(=O)和S(=O)₂，所述环任选地被1至4个独立地选自以下各项的取代基取代：卤素、C₁-C₂烷基、C₁-C₂卤代烷基、C₁-C₂烷氧基、C₁-C₂卤代烷氧基、-CN和-NO₂；

每个R¹⁸独立地是卤素、-CN、C₁-C₂烷基或C₁-C₂卤代烷基；

R¹⁹是H、C₁-C₄烷基或C₁-C₄卤代烷基；

R²⁰是C₁-C₄烷基或C₁-C₄卤代烷基；

R²¹是H或C₁-C₄烷基；

R²²是C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基或C₃-C₆环烷基；

n独立地是0、1或2；并且

p是0或1。

2. 如权利要求1所述的化合物，其中：

A¹、A²、A³、A⁴和A⁵各自独立地是CR²；

X是O或CH₂；

X¹和X²各自独立地是CR³；

每个R²独立地是H、卤素、-CN、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₁-C₄烷氧基或C₁-C₄卤代烷氧基；

每个R³独立地是H、卤素、-CN、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₁-C₄烷氧基或C₁-C₄卤代烷氧基；并且

J是C(=Z)NR⁴R⁵。

3. 如权利要求2所述的化合物，其中：

A⁴是CH；

A⁵是CH；

X是O；

每个R²独立地是H、卤素、C₁-C₂烷基、C₁-C₂卤代烷基、C₁-C₂烷氧基或C₁-C₂卤代烷氧基；

每个R³独立地是H、卤素、C₁-C₂烷基、C₁-C₂卤代烷基、C₁-C₂烷氧基或C₁-C₂卤代烷氧基；

Z是O；

R⁴是H、C₁-C₄烷基、C₂-C₇烷基羰基或C₂-C₇烷氧基羰基；

R⁵是H、CHR¹²NHR¹¹；或C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₆环烷基、C₄-C₇烷基环烷基或C₄-C₇环烷基烷基，各自任选地被一个或多个独立地选自R⁷的取代基取代；

每个R⁷独立地是卤素、C₁-C₄烷基或C₁-C₄烷氧基；

R¹¹是H、C₁-C₆烷基、C₂-C₇烷基羰基、C₂-C₇卤代烷基羰基或C₂-C₇烷氧基羰基；

R¹²是H；或C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₆环烷基、C₄-C₇烷基环烷基或C₄-C₇环烷基烷基，各自任选地被一个或多个独立地选自R⁷的取代基取代。

4. 如权利要求3所述的化合物，其中：

每个 R^2 独立地是H、卤素、 C_1 - C_2 卤代烷基或 C_1 - C_2 卤代烷氧基；

每个 R^3 是H；

R^4 是H；

R^5 是 $CHR^{12}NHR^{11}$ ；或 C_1 - C_4 烷基、 C_3 - C_6 环烷基、或 C_4 - C_7 环烷基烷基，各自任选地被一个或多个独立地选自 R^7 的取代基取代；

R^{11} 是H；并且

R^{12} 是 C_1 - C_4 烷基。

5. 如权利要求4所述的化合物，其中：

R^5 是环丙基、环丙基甲基或 $-CH(CH_3)C(=O)NH_2$ 。

6. 如权利要求1所述的化合物，其中：

A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 和 A^5 各自独立地是 CR^2 ；

X是O或 CH_2 ；

X^1 和 X^2 各自独立地是 CR^3 ；

每个 R^2 独立地是H、卤素、 $-CN$ 、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基；

每个 R^3 独立地是H、卤素、 $-CN$ 、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基；并且

J是 $CH(R^6)N(R^{13})C(=Z)R^{14}$ 。

7. 如权利要求6所述的化合物，其中：

A^4 是CH；

A^5 是CH；

X是O；

每个 R^2 独立地是H、卤素、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 卤代烷氧基；

每个 R^3 独立地是H、卤素、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 卤代烷氧基；

Z是O；

R^6 是H、 C_1 - C_3 烷基或 C_1 - C_3 卤代烷基；并且

R^{13} 是H、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_7 烷基羰基或 C_2 - C_7 烷氧基羰基。

8. 如权利要求7所述的化合物，其中：

每个 R^2 独立地是H、卤素、 C_1 - C_2 卤代烷基或 C_1 - C_2 卤代烷氧基；

每个 R^3 是H；

R^6 是H；

R^{13} 是H；

R^{14} 是任选地被卤素取代的 C_1 - C_6 烷基；或者

R^{14} 是 C_3 - C_6 环烷基或 C_4 - C_7 环烷基烷基，各自任选地被最高达一个环丙基和最高达2个选自卤素、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 卤代烷基的取代基取代；或者

R^{14} 是 $NR^{17a}R^{17b}$ ；

R^{17a} 是 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷基；并且

R^{17b} 是H。

9. 如权利要求8所述的化合物，其中：

R¹⁴是任选地被卤素取代的C₁-C₄烷基。

10. 如权利要求9所述的化合物,其中:

R¹⁴是甲基或乙基。

11. 如权利要求1所述的化合物,该化合物选自下组:

N-环丙基-5-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,

N-环丙基-5-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,

(R)-N-环丙基-5-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,

(S)-N-环丙基-5-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,

N-环丙基-5-[4,5-二氢-5-(三氟甲基)-5-[3-(三氟甲基)苯基]-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,

N-(环丙基甲基)-5-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,

N-(环丙基甲基)-5-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,

N-(环丙基甲基)-5-[4,5-二氢-5-(三氟甲基)-5-[3-(三氟甲基)苯基]-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,

N-(2-氨基-1-甲基-2-氧代乙基)-5-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,

N-(2-氨基-1-甲基-2-氧代乙基)-5-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,

N-(2-氨基-1-甲基-2-氧代乙基)-5-[4,5-二氢-5-(三氟甲基)-5-[3-(三氟甲基)苯基]-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,

N-[[5-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-基]甲基]乙酰胺,

N-[[5-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-基]甲基]乙酰胺,以及

N-[[5-[4,5-二氢-5-(三氟甲基)-5-[3-(三氟甲基)苯基]-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-基]甲基]乙酰胺。

12. 一种组合物,其包含如权利要求1或前述权利要求中任一项所述的化合物和至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的附加组分,所述组合物任选地进一步包含至少一种附加生物学活性化合物或药剂。

13. 如权利要求12所述的组合物,其中,该至少一种附加生物学活性化合物或药剂选自阿巴汀、乙酰甲胺磷、灭螨醌、啉虫脒、氟丙菊酯、双丙环虫酯、磺胺螨酯、双甲脒、阿维菌素、印楝素、保棉磷、丙硫克百威、杀虫磺、联苯菊酯、联苯肼酯、双三氟虫脒、硼酸盐、噻嗪酮、甲萘威、克百威、杀螟丹、伐虫脒、氯虫苯甲酰胺、溴虫腈、氟啉脒、毒死蜱、甲基毒死蜱、环虫酰

肼、四螨嗪、噻虫胺、溴氰虫酰胺、环溴虫酰胺、乙氰菊酯、环氧虫啉、丁氟螨酯、氟氯氰菊酯、高效氟氯氰菊、三氟氯氰菊酯、精高效氯氟氰菊酯、高效氯氟氰菊酯、氯氰菊酯、顺式氯氰菊酯、 ζ -氯氰菊酯、灭蝇胺、溴氰菊酯、丁醚脲、二嗪磷、狄氏剂、除虫脲、四氟甲醚菊酯、杀虫双、乐果、呋虫胺、苯虫醚、甲氨基阿维菌素、硫丹、高氰戊菊酯、乙虫腈、醚菊酯、乙螨唑、苯丁锡、杀螟硫磷、苯硫威、苯氧威、甲氰菊酯、氰戊菊酯、氟虫腈、氟麦托醌、氟啶虫酰胺、氟虫双酰胺、氟氰戊菊酯、啉虫胺、氟虫脲、氟菌螨酯、联氟砒、氟吡菌酰胺、氟吡呋喃酮、氟胺氰菊酯、氟胺氰戊菊酯、地虫硫磷、伐虫脲、噻唑膦、氯虫酰胺、七氟甲醚菊酯、氟铃脲、噻螨酮、氟蚁腓、吡虫啉、茚虫威、杀虫肥皂、异丙胺磷、虱螨脲、马拉硫磷、氯氟醚菊酯、氰氟虫腓、四聚乙醛、甲胺磷、杀扑磷、甲硫威、灭多威、烯虫酯、甲氧滴滴涕、甲氧虫酰胺、甲氧苄氟菊酯、久效磷、单氟菊酯、烟碱、烯啶虫胺、硝虫噻嗪、氟酰胺、多氟脲、杀线威、对硫磷、甲基对硫磷、氯菊酯、甲拌磷、伏杀硫磷、亚胺硫磷、磷胺、抗蚜威、丙溴磷、丙氟菊酯、炔螨特、丙苯炔菊酯、吡氟丁酰胺、吡蚜酮、啉啉虫胺、除虫菊素、哒螨灵、啉虫丙醚、吡氟啉虫啉、啉虫胺、吡啉虫啉、吡丙醚、鱼藤酮、兰尼碱、氟硅菊酯、乙基多杀菌素、多杀菌素、螺螨酯、螺甲螨酯、螺虫乙酯、硫丙磷、氟啶虫胺腈、虫酰胺、吡螨胺、氟苯脲、七氟菊酯、杀虫畏、胺菊酯、四氟醚菊酯、噻虫啉、噻虫嗪、硫双威、杀虫双、噻唑沙芬、啉虫酰胺、四溴菊酯、啉蚜威、敌百虫、三氟苯啉啉、杀铃脲、苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素、昆虫病原细菌、昆虫病原病毒和昆虫病原真菌。

14. 如权利要求13所述的组合物,其中,该至少一种附加生物学活性化合物或药剂选自阿巴汀、啉虫脲、氟丙菊酯、双丙环虫酯、双甲脲、阿维菌素、印楝素、丙硫克百威、杀虫磺、联苯菊酯、噻嗪酮、甲萘威、杀螟丹、氯虫苯甲酰胺、溴虫腈、毒死蜱、噻虫胺、溴氰虫酰胺、环溴虫酰胺、乙氰菊酯、氟氯氰菊酯、高效氟氯氰菊、三氟氯氰菊酯、精高效氯氟氰菊酯、高效氯氟氰菊酯、氯氰菊酯、顺式氯氰菊酯、 ζ -氯氰菊酯、灭蝇胺、溴氰菊酯、狄氏剂、呋虫胺、苯虫醚、甲氨基阿维菌素、硫丹、高氰戊菊酯、乙虫腈、醚菊酯、乙螨唑、杀螟硫磷、苯硫威、苯氧威、氰戊菊酯、氟虫腈、氟麦托醌、氟啶虫酰胺、氟虫双酰胺、氟虫脲、氟菌螨酯、联氟砒、丁虫腈、氟吡呋喃酮、氟胺氰菊酯、伐虫脲、噻唑膦、七氟甲醚菊酯、氟铃脲、氟蚁腓、吡虫啉、茚虫威、虱螨脲、氯氟醚菊酯、氰氟虫腓、甲硫威、灭多威、烯虫酯、甲氧虫酰胺、甲氧苄氟菊酯、单氟菊酯、烯啶虫胺、硝虫噻嗪、氟酰胺、杀线威、吡氟丁酰胺、吡蚜酮、除虫菊素、哒螨灵、啉虫丙醚、啉虫胺、吡丙醚、兰尼碱、乙基多杀菌素、多杀菌素、螺螨酯、螺甲螨酯、螺虫乙酯、氟啶虫胺腈、虫酰胺、胺菊酯、四氟醚菊酯、噻虫啉、噻虫嗪、硫双威、杀虫双、四溴菊酯、啉蚜威、三氟苯啉啉、杀铃脲、苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素、苏云金芽孢杆菌的所有菌株和核型多角体病毒的所有毒株。

15. 一种用于保护生物体免受无脊椎寄生性有害生物侵害的组合物,其包含杀寄生虫有效量的如权利要求1或前述权利要求中任一项所述的化合物和至少一种载体。

16. 如权利要求15所述的组合物,其中,该生物体是植物。

17. 如权利要求15所述的组合物,其中,该生物体是动物。

18. 如权利要求17所述的组合物,该组合物呈用于口服施用的形式。

19. 如权利要求12-16中任一项所述的组合物,其进一步包含液体肥料。

20. 如权利要求19所述的组合物,其中,所述液体肥料是水基的。

21. 一种土壤浸液制剂,其包含如权利要求12-16中任一项所述的组合物。

22. 一种喷雾组合物,其包含如权利要求12-17中任一项所述的组合物、和推进剂。
23. 一种诱饵组合物,其包含:如权利要求12-15中任一项所述的组合物、一种或多种食物材料、任选的引诱剂和任选的湿润剂。
24. 一种用于防治无脊椎有害生物的诱捕装置,其包含:如权利要求23所述的诱饵组合物和适配成容纳所述诱饵组合物的外壳,其中,该外壳具有至少一个开口,该开口的尺寸设定成允许该无脊椎有害生物通过该开口,如此该无脊椎有害生物能够从该外壳以外的位置接近所述诱饵组合物,并且其中该外壳进一步适配成放置在该无脊椎有害生物可能或已知的活动场所中或附近。
25. 一种组合物,其包含如权利要求12-15中任一项所述的组合物,其中,该组合物是选自粉尘剂、粉末、颗粒剂、球剂、粒剂、锭剂、片剂和填充膜的固体组合物。
26. 如权利要求12-18中任一项所述的组合物,其中,该组合物是水可分散的或水溶性的。
27. 一种包含如权利要求12-15中任一项所述的组合物的液体或干制剂,该液体或干制剂用于滴灌系统、种植期间的垄沟、手持式喷雾器、背负式喷雾器、喷杆式喷雾器、地面喷雾器、空气施加、无人飞行载具或种子处理。
28. 如权利要求27所述的液体或干制剂,其中,所述制剂以超低体积喷雾。
29. 一种用于防治无脊椎有害生物的方法,该方法包括使该无脊椎有害生物或其环境与生物学有效量的如权利要求1或前述权利要求中任一项所述的化合物接触。
30. 如权利要求29所述的方法,其中,该环境是土壤。
31. 如权利要求29所述的方法,其中,该环境是植物。
32. 如权利要求29所述的方法,其中,该环境是动物。
33. 如权利要求29所述的方法,其中,该环境是种子。
34. 如权利要求33所述的方法,其中,该种子被配制为包括以下项的组合物的如权利要求1所述的化合物包衣:成膜剂或粘合剂。
35. 一种经处理的种子,其包含以处理前该种子的重量计从约0.0001%至1%的量的如权利要求1所述的化合物。

用于防治无脊椎有害生物の色烯酮化合物

技术领域

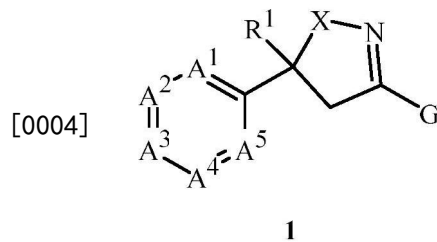
[0001] 本披露涉及适用于农学和非农学用途的某些色烯酮化合物、其N-氧化物、盐和组合物,以及它们用于在农学和非农学环境中防治无脊椎有害生物诸如节肢动物的方法。

背景技术

[0002] 防治无脊椎有害生物在实现高作物效率中是极其重要的。无脊椎有害生物对生长中和储存的农作物的损害可导致生产力显著降低,并由此导致消费者的成本增加。在林业、温室作物、观赏植物、苗圃作物、储存食品和纤维产品、牲畜、家庭、草皮、木材产品以及公共健康和动物健康中的无脊椎有害生物的防治也是重要的。为了这些目的,许多产品是可商购的,但持续需要更有效、较低成本、较低毒性、对环境更安全或具有不同的作用位点的新化合物。

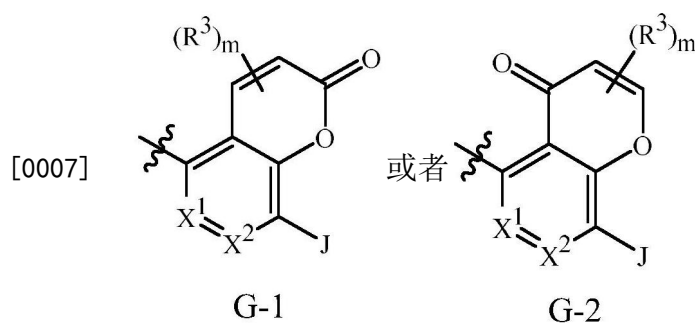
发明内容

[0003] 本披露涉及式1的化合物(包括所有几何异构体和立体异构体)、其N-氧化物和盐,以及含有它们的组合物,以及它们用于防治无脊椎有害生物用途:



[0005] 其中

[0006] G是



[0008] A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 和 A^5 各自独立地是N或 CR^2 ,前提是 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 和 A^5 中不超过一个是N;

[0009] X是O、S或 CH_2 ;

[0010] X^1 和 X^2 各自独立地是N或 CR^3 ;

[0011] R^1 是 C_1 - C_2 卤代烷基;

[0012] 每个 R^2 独立地是H、卤素、-CN、- NO_2 、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 烷基磺基、 C_1 - C_4 卤代烷基磺基、 C_1 - C_4 烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 烷基磺酰基或 C_1 - C_4 卤代烷基磺酰基;

[0013] 每个 R^3 独立地是H、卤素、-CN、-NO₂、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄卤代烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄卤代烷硫基、C₁-C₄烷基亚磺酰基、C₁-C₄卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄烷基磺酰基或C₁-C₄卤代烷基磺酰基；

[0014] m是0、1或2；

[0015] J是C(=Z)NR⁴R⁵或CH(R⁶)N(R¹³)C(=Z)R¹⁴；

[0016] 每个Z独立地是O或S；

[0017] R⁴是H、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₆环烷基、C₄-C₇烷基环烷基、C₄-C₇环烷基烷基、C₂-C₇烷基羰基或C₂-C₇烷氧基羰基；

[0018] R⁵是H、OR¹⁰、NR¹¹R¹²、SO₂NR¹¹R¹²、C(R¹²)=NOR¹¹、CHR¹²NHR¹¹或Q¹；或C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₆环烷基、C₄-C₇烷基环烷基或C₄-C₇环烷基烷基，各自任选地被一个或多个独立地选自R⁷的取代基取代；或者

[0019] R⁴和R⁵连同它们所附接的氮一起形成3元至6元环，该环含有选自碳原子和最高达两个独立地选自氮、硫和氧的另外原子的环成员，其中该硫原子环成员选自S、S(=O)和S(=O)₂，所述环任选地被1至4个独立地选自以下各项的取代基取代：卤素、C₁-C₂烷基、C₁-C₂卤代烷基、C₁-C₂烷氧基、C₁-C₂卤代烷氧基、-CN和-NO₂；

[0020] R⁶是H、卤素、-CN、C₁-C₃烷基或C₁-C₃卤代烷基；

[0021] 每个R⁷独立地是卤素、C₁-C₆烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆烷硫基、C₁-C₆烷基亚磺酰基、C₁-C₆烷基磺酰基、C₁-C₆烷基氨基、C₂-C₈二烷基氨基、C₃-C₆环烷基氨基、C₂-C₇烷基羰基、C₂-C₇烷氧基羰基、C₂-C₇烷基氨基羰基、C₃-C₇环烷基氨基羰基、C₃-C₇烯基氨基羰基、C₃-C₇炔基氨基羰基、C₃-C₉二烷基氨基羰基、C₂-C₇卤代烷基羰基、C₂-C₇卤代烷氧基羰基、C₂-C₇卤代烷基氨基羰基、C₃-C₉卤代二烷基氨基羰基、羟基、-NH₂、-CN、-CONH₂；-NO₂或Q²；

[0022] Q¹是5元或6元芳族环或4元至11元部分不饱和环或环体系，其任选地含有最高达三个选自最高达1个氧、最高达1个硫和最高达3个氮的杂原子，其中最高达2个碳原子环成员独立地选自C(=O)和C(=S)并且该硫原子环成员选自S、S(=O)和S(=O)₂，每个环或环体系任选地被一个或多个独立地选自R⁸的取代基取代；

[0023] 每个Q²独立地是苯环、5元或6元芳族杂环或3元至6元非芳族杂环，每个环任选地被一个或多个独立地选自R⁹的取代基取代；

[0024] 每个R⁸独立地是卤素、C₁-C₆烷基、C₁-C₆卤代烷基、C₃-C₆环烷基、C₃-C₆卤代环烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆卤代烷氧基、C₁-C₆烷硫基、C₁-C₆卤代烷硫基、C₁-C₆烷基亚磺酰基、C₁-C₆卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₆烷基磺酰基、C₁-C₆卤代烷基磺酰基、C₁-C₆烷基氨基、C₂-C₆二烷基氨基、C₂-C₄烷氧基羰基、C₂-C₇烷基氨基羰基、C₃-C₉二烷基氨基羰基、-CONH₂、-CN或-NO₂；

[0025] 每个R⁹独立地是卤素、C₁-C₆烷基、C₁-C₆卤代烷基、C₃-C₆环烷基、C₃-C₆卤代环烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆卤代烷氧基、C₁-C₆烷硫基、C₁-C₆卤代烷硫基、C₁-C₆烷基亚磺酰基、C₁-C₆卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₆烷基磺酰基、C₁-C₆卤代烷基磺酰基、C₁-C₆烷基氨基、C₂-C₆二烷基氨基、-CN、-NO₂、苯基或吡啶基；

[0026] R¹⁰是H；或C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₆环烷基、C₄-C₇烷基环烷基或C₄-C₇环烷基烷基，各自任选地被一个或多个卤素取代；

[0027] R¹¹是H、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₆环烷基、C₄-C₇烷基环烷基、C₄-C₇环烷基烷基、C₂-C₇烷基羰基、C₂-C₇卤代烷基羰基或C₂-C₇烷氧基羰基；

[0028] R^{12} 是H或 Q^3 ;或 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 环烷基、 C_4-C_7 烷基环烷基或 C_4-C_7 环烷基烷基,各自任选地被一个或多个独立地选自 R^7 的取代基取代;或者

[0029] R^{11} 和 R^{12} 连同它们所附接的氮一起形成3元至6元环,该环含有选自碳原子和最高达一个独立地选自氮、硫和氧的另外原子的环成员,其中该硫原子环成员选自S、 $S(=O)$ 和 $S(=O)_2$,所述环任选地被1至4个独立地选自以下各项的取代基取代:卤素、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 卤代烷基、 C_1-C_2 烷氧基、 C_1-C_2 卤代烷氧基、-CN和- NO_2 ;

[0030] Q^3 是苯环或5元或6元杂环,每个环任选地被一个或多个独立地选自 R^9 的取代基取代;

[0031] R^{13} 是H、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_7 烷基羰基、 C_2-C_4 卤代烷基羰基、 C_2-C_7 烷氧基羰基或 C_2-C_4 烷氧基烷基;

[0032] R^{14} 是任选地被卤素、 OR^{19} 、 $S(=O)_nR^{20}$ 或 $NR^{21}C(=O)R^{22}$ 取代的 C_1-C_6 烷基;或者

[0033] R^{14} 是 C_3-C_6 环烷基或 C_4-C_7 环烷基烷基,各自任选地被最高达一个环丙基和最高达4个选自卤素、-CN、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 卤代烷基的取代基取代;或者

[0034] R^{14} 是 $(CH_2)_pQ^4$;或者

[0035] R^{14} 是 OR^{16} 或 $NR^{17a}R^{17b}$;

[0036] Q^4 是3元至6元饱和杂环,其含有选自碳原子和一个独立地选自一个氧和一个硫的杂原子的环成员,其中该硫原子环成员选自S、 $S(=O)$ 或 $S(=O)_2$,每个环任选地被最高达2个独立地选自 R^{18} 的取代基取代;

[0037] R^{16} 是 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 卤代烷基;

[0038] R^{17a} 是H、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基或 C_3-C_6 环烷基;

[0039] R^{17b} 是H、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基或 C_3-C_6 环烷基;

[0040] R^{17a} 和 R^{17b} 连同它们所附接的氮一起形成3元至6元环,该环含有选自碳原子和最高达一个独立地选自氮、硫和氧的另外原子的环成员,其中该硫原子环成员选自S、 $S(=O)$ 和 $S(=O)_2$,所述环任选地被1至4个独立地选自以下各项的取代基取代:卤素、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 卤代烷基、 C_1-C_2 烷氧基、 C_1-C_2 卤代烷氧基、-CN和- NO_2 ;

[0041] 每个 R^{18} 独立地是卤素、-CN、 C_1-C_2 烷基或 C_1-C_2 卤代烷基;

[0042] R^{19} 是H、 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 卤代烷基;

[0043] R^{20} 是 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 卤代烷基;

[0044] R^{21} 是H或 C_1-C_4 烷基;

[0045] R^{22} 是 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基或 C_3-C_6 环烷基;

[0046] n独立地是0、1或2;并且

[0047] p是0或1。

[0048] 本披露还提供了一种组合物,该组合物包含式1的化合物、其N-氧化物或盐以及至少一种选自由表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂组成的组的附加组分。在一个实施例中,本披露还提供了一种用于防治无脊椎有害生物的组合,该组合物包含式1的化合物、其N-氧化物或盐以及至少一种选自由表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂组成的组的附加组分,所述组合物任选地进一步包含至少一种附加生物学活性化合物或药剂。

[0049] 本披露还提供了一种用于防治无脊椎有害生物的方法,该方法包括使无脊椎有害生物或其环境与生物学有效量的式1的化合物、其N-氧化物或盐(例如,作为本文所述的组

合物)接触。本披露还涉及这样的方法,其中无脊椎有害生物或其环境与包含生物学有效量的式1的化合物、其N-氧化物或盐以及至少一种选自由表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂组成的组的附加组分的组合物接触,所述组合物任选地进一步包含生物学有效量的至少一种附加生物学活性化合物或药剂。

[0050] 本披露还提供了一种用于防治无脊椎有害生物的方法,该方法包括使无脊椎有害生物或其环境与生物学有效量的上述组合物中的任一种接触,其中该环境是植株。

[0051] 本披露还提供了一种用于防治无脊椎有害生物的方法,该方法包括使无脊椎有害生物或其环境与生物学有效量的上述组合物中的任一种接触,其中该环境是动物。

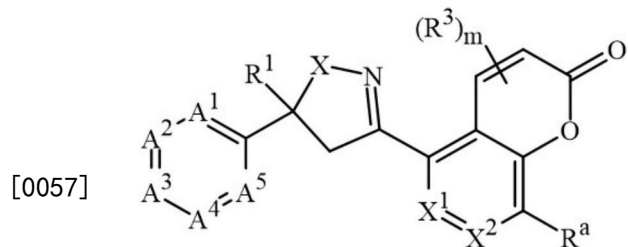
[0052] 本披露还提供了一种用于防治无脊椎有害生物的方法,该方法包括使无脊椎有害生物或其环境与生物学有效量的上述组合物中的任一种接触,其中该环境是种子。

[0053] 本披露还提供了一种用于保护种子免受无脊椎有害生物侵害的方法,该方法包括使种子与生物学有效量的式1的化合物、其N-氧化物或盐(例如,作为本文所述的组合物)接触。本披露还涉及经处理的种子(即与式1的化合物接触的种子)。

[0054] 本披露还提供了一种用于增加作物植株的活力(vigor)的方法,该方法包括使作物植株、生长出作物植株的种子或作物植株的所在地(例如,生长介质)与生物学有效量的式1的化合物(例如,作为本文所述的组合物)接触。

[0055] 本披露进一步提供了一种用于保护动物免受无脊椎寄生性有害生物侵害的方法,该方法包括向动物施用杀寄生虫有效量的式1的化合物、其N-氧化物或盐(例如,作为本文所述的组合物)。本披露还提供了式1的化合物、其N-氧化物或盐(例如,作为本文所述的组合物)在保护动物免受无脊椎有害生物侵害中的用途。

[0056] 本披露还涉及式2的化合物(包括所有立体异构体)、其N-氧化物和盐:



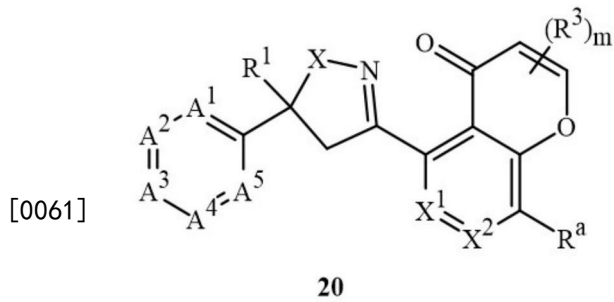
2

其中R^a是Cl、Br或I

[0058] 其中

[0059] A¹、A²、A³、A⁴、A⁵、R¹、R³、m、X、X₁和X₂是如以上对式1所定义的。

[0060] 本披露进一步涉及式20的化合物(包括所有立体异构体)、其N-氧化物和盐:



其中R^a是Cl、Br或I

[0062] 其中

[0063] A¹、A²、A³、A⁴、A⁵、R¹、R³、m、X、X₁和X₂是如以上对式1所定义的。

具体实施方式

[0064] 如本文所使用的，术语“包含 (comprises)”、“包含 (comprising)”、“包括 (includes)”、“包括 (including)”、“具有 (has)”、“具有 (having)”、“含有 (contains)”、“含有 (containing)”、“特征为 (characterized by)”或其任何其他变体，旨在涵盖非排他性包括，受到明确指出的任何限制。例如，包含一系列要素的组合物、混合物、工艺或方法不一定仅限于那些要素，而是可以包括未明确列出的其他要素或此类组合物、混合物、工艺或方法固有的其他要素。

[0065] 连接短语“由……组成”排除任何未指出的要素、步骤或成分。如果在权利要求中，则此短语将使权利要求为封闭式，不包括除所述那些外的材料，但与其通常相关的杂质除外。当短语“由……组成”出现在权利要求主体的子句中而非紧接前序部分时，该短语仅仅限制该子句中阐述的要素；整体上，该权利要求并不排除其他要素。

[0066] 连接短语“基本上由…组成”用于限定除了字面披露的那些以外还包括材料、步骤、特征、组分、或元素的组合物或方法，前提是这些附加的材料、步骤、特征、组分、或元素不会实质影响请求保护的披露的基本和新颖特征。术语“基本上由……组成”居于“包含”和“由……组成”中间。

[0067] 当申请人已经用开放式术语如“包含 (comprising)”定义了实施例或其一部分时，则应易于理解 (除非另外说明)，说明书应被解释为还使用术语“基本上由……组成”或“由……组成”描述该实施例。

[0068] 此外，除非明确相反地指出，否则“或”是指包含性的或非排他性的或。例如，条件A或B由以下中任一个满足：A为真 (或存在) 且B为假 (或不存在)、A为假 (或不存在) 且B为真 (或存在) 以及A和B皆为真 (或存在)。

[0069] 同样，在本披露的元素或组分前的不定冠词“一个/一种 (a/an)”关于元素或组分的例子 (即，出现) 的数量旨在是非限制性的。因此，“一个/一种 (a或an)”应被理解为包括一个/一种或至少一个/一种，并且要素或组分的单数单词形式也包括复数，除非数字显然意指单数。

[0070] 如在本披露中所提及，术语“无脊椎有害生物”包括作为有害生物具有经济重要性的节肢动物、腹足动物、线虫和蠕虫。术语“节肢动物”包括昆虫、螨虫、蜘蛛、蝎子、蜈蚣、千

足虫、鼠妇(pill bug)和综合虫(symphylan)。术语“腹足动物”包括蜗牛、蛞蝓和其他柄眼目(Stylommatophora)。术语“线虫”包括线虫动物门(Nematoda)成员,诸如植食性线虫和寄生于动物的蠕虫线虫。术语“蠕虫”包括所有寄生虫,诸如蛔虫(线虫动物门)、心丝虫(线虫动物门,胞管肾纲(Secernentea))、吸虫(fluke)(扁形动物门(Platyhelminthes),吸虫纲(Tematoda))、棘头虫(棘头动物门(Acanthocephala))和绦虫(扁形动物门,绦虫纲(Cestoda))。

[0071] 在本披露的上下文中,“无脊椎有害生物防治”意指抑制无脊椎有害生物的发育(包括死亡、摄食减少和/或交配干扰),并且相关的表述类似地定义。

[0072] 术语“农学”是指诸如用于食品和纤维的大田作物的生产,并且包括玉蜀黍(maize)或玉米、大豆和其他豆类、稻、谷物(例如,小麦、燕麦、大麦、黑麦和稻)、叶类蔬菜(例如,生菜、卷心菜和其他油菜作物)、果实类蔬菜(例如,西红柿、胡椒、茄子、十字花科植物和瓜类作物(cucurbit))、土豆、甘薯、葡萄、棉花、树果(例如,仁果类(pome)、核果类(stone)和柑橘类)、小果(例如,浆果和樱桃)和其他特种作物(specialty crop)(例如,低芥酸菜籽(canola)、向日葵和橄榄)的生长。

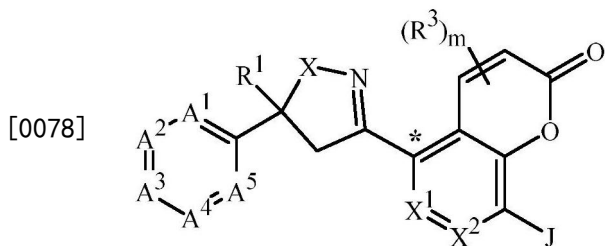
[0073] 术语“非农学”是指不同于大田作物,诸如园艺作物(例如,温室、苗圃或不在大田生长的观赏植物)、住宅、农业、商业和工业结构、草皮(例如,草场(sod farm)、牧场、高尔夫球场、草坪、运动场等)、木材产品、储存产品、农林业和植被管理、公共健康(即人类)和动物健康(例如,家养动物诸如宠物、家畜和家禽,非家养动物诸如野生动物)应用。

[0074] 术语“作物活力”是指作物植株的生长速率或生物量积累。“活力的增加”是指作物植株相对于未经处理的对照作物植株在生长或生物量积累上的增加。术语“作物产量”是指收获作物植株后获得的作物材料在数量和质量上的回报。“作物产量的增加”是指相对于未经处理的对照作物植株的作物产量增加。

[0075] 术语“生物学有效量”是指当施加于(即接触)待防治的无脊椎有害生物或其环境,或植株、生长出该植株的种子或该植株的所在地(例如,生长介质)以保护植株免受无脊椎有害生物的伤害或为了其他期望的效果(例如,增加植株活力)时,足以产生所期望的生物效应的生物学活性化合物(例如,式1的化合物)的量。

[0076] 非农学应用包括通过向待保护动物施用杀寄生虫有效(即生物学有效)量的本披露化合物(典型地呈被配制用于兽医用途的组合物的形式)来保护动物免受无脊椎寄生性有害生物的伤害。如在本披露和权利要求中所提及,术语“杀寄生虫的”和“杀寄生虫地”是指对无脊椎寄生性有害生物的可观察影响,以保护动物免受有害生物的伤害。杀寄生虫效果典型地与减少目标无脊椎寄生性有害生物的出现或活动有关。此类对有害生物的影响包括坏死、死亡、生长迟缓、移动性降低或留在宿主动物身上或体内的能力降低、取食减少和生殖抑制。这些对无脊椎寄生性有害生物的影响防治(包括预防、减少或消除)动物的寄生虫侵害或感染。

[0077] 结构片段中的波浪线表示片段与分子其余部分的附接点。例如,当式1中的可变G定义为G-1时,则在色烯酮G-1用星号(*)标识的位置上横贯键的波浪线意指该色烯酮G-1在所述位置附接至式1的结构其余部分,如以下所示。



[0079] 在以上详述中,术语“烷基”,单独使用或在复合词诸如“烷硫基”或“卤代烷基”中使用,包括直链或支链烷基,诸如甲基、乙基、正丙基、异丙基、或不同的丁基、戊基、或己基异构体。“烯基”包括直链或支链的烯烃,如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基和不同的丁烯基、戊烯基和己烯基异构体。“烯基”还包括多烯,如1,2-丙二烯基和2,4-己二烯基。“炔基”包括直链或支链的炔烃,如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基和不同的丁炔基、戊炔基和己炔基异构体。“炔基”还可包括由多个三键构成的部分,诸如2,5-己二炔基。“亚烷基”表示直链或支链的烷二基(alkanediyl)。“亚烷基”的实例包括 CH_2 、 CH_2CH_2 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$ 和不同的丁烯异构体。“亚烯基”表示含有一个烯键的直链或支链的烯二基(alkenediyl)。“亚烯基”的实例包括 $\text{CH}=\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}$ 、 $\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)$ 和不同的亚丁烯基(butenylene)异构体。“亚炔基”表示含有一个三键的直链或支链的炔二基(alkynediyl)。“亚炔基”的实例包括 $\text{C}\equiv\text{C}$ 、 $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{C}$ 、 $\text{C}\equiv\text{CCH}_2$ 和不同的亚丁炔基异构体。

[0080] “烷基氨基”包括被直链或支链烷基取代的NH基团。“烷基氨基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NH}$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{CHNH}$ 。“二烷基氨基”的实例包括 $(\text{CH}_3)_2\text{N}$ 、 $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{N}$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{N}$ 。“烯基胺”包括被直链或支链烯烃取代的NH基团。“烯基胺”的实例包括 $\text{CH}_2=\text{CHNH}$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{NH}$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}=\text{CHNH}$ 和不同的丁烯基胺、戊烯基胺和己烯基胺异构体。“炔基胺”包括被直链或支链炔烃取代的NH基团。“炔基胺”的实例包括 $\text{HC}\equiv\text{CNH}$ 、 $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{NH}$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}\equiv\text{CNH}$ 和不同的丁炔基胺、戊炔基胺和己炔基胺异构体。

[0081] “烷氧基”包括例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基和不同的丁氧基、戊氧基和己氧基异构体。“烷氧基烷基”表示烷基上的烷氧基取代。“烷氧基烷基”的实例包括 CH_3OCH_2 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 。

[0082] “烷硫基”包括支链或直链的烷硫基部分,如甲硫基、乙硫基和不同的丙硫基、丁硫基、戊硫基和己硫基异构体。“烷基亚磺酰基”包括烷基亚磺酰基的两种对映异构体。“烷基亚磺酰基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})-$ 以及不同的丁基亚磺酰基、戊基亚磺酰基和己基亚磺酰基异构体。“烷基磺酰基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2-$ 以及不同的丁基磺酰基、戊基磺酰基和己基磺酰基异构体。“烷硫基烷基”表示烷基上的烷硫基取代。“烷硫基烷基”的实例包括 CH_3SCH_2 、 $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 。

[0083] “烷基羰基”表示键合到 $\text{C}(=\text{O})$ 部分上的直链或支链的烷基部分。“烷基羰基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})-$ 。“烷氧基羰基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})$ 以及不同的丁氧基羰基、戊氧基羰基和己氧基羰基异构体。

[0084] 术语“烷基氨基羰基”表示附接至 $\text{C}(=\text{O})$ 基团并通过 $\text{C}(=\text{O})$ 基团连接的直链或支链烷基氨基。“烷基氨基羰基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$

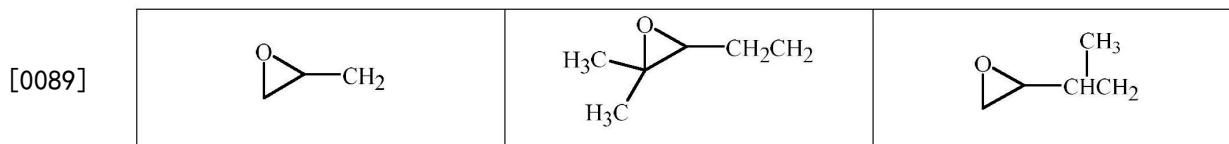
和 $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(=\text{O})$ 。“二烷基氨基羰基”的实例包括 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ 。术语“烯基氨基羰基”表示附接至 $\text{C}(=\text{O})$ 基团并通过 $\text{C}(=\text{O})$ 基团连接的直链或支链烯基氨基。“烯基氨基羰基”的实例包括 $\text{CH}_2=\text{CHNHC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}=\text{CHNHC}(=\text{O})$ 。术语“炔基氨基羰基”表示附接至 $\text{C}(=\text{O})$ 基团并通过 $\text{C}(=\text{O})$ 基团连接的直链或支链炔基氨基。“炔基氨基羰基”的实例包括 $\text{HC}\equiv\text{CNHC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}\equiv\text{CCH}_2\text{NHC}(=\text{O})$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}\equiv\text{CNHC}(=\text{O})$ 。

[0085] “环烷基”包括例如环丙基、环丁基、环戊基和环己基。术语“烷基环烷基”表示环烷基部分上的烷基取代，并且包括例如乙基环丙基、异丙基环丁基、3-甲基环戊基和4-甲基环己基。术语“环烷基烷基”表示烷基部分上的环烷基取代。“环烷基烷基”的实例包括环丙基甲基、环戊基乙基、环己基甲基以及其他键合至直链或支链烷基的环烷基部分。术语“环烷氧基”表示通过氧原子连接的环烷基，诸如环戊氧基和环己氧基。“环烷基氨基”表示被环烷基取代的NH基团。“环烷基氨基”的实例包括环丙基氨基和环己基氨基。“环烷基氨基羰基”表示键合至 $\text{C}(=\text{O})$ 基团的环烷基氨基，例如，环戊基氨基羰基和环己基氨基羰基。

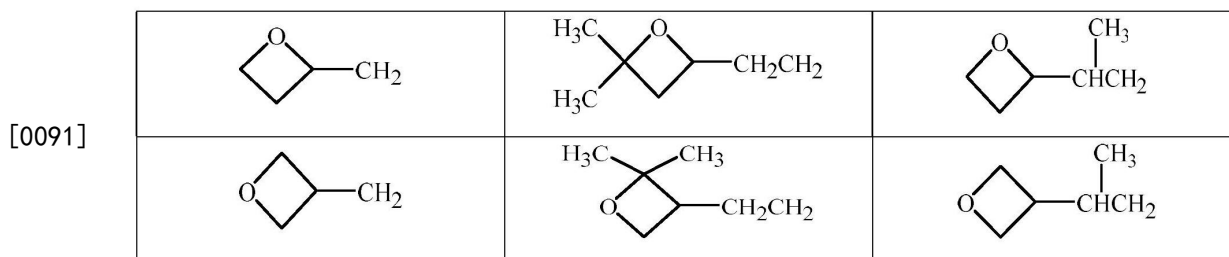
[0086] 术语“卤素”，单独地或在复合词如“卤代烷基”中，或者当在描述如“被卤素取代的烷基”中使用，包括氟、氯、溴或碘。此外，当在复合词如“卤代烷基”中使用，或者当在描述如“被卤素取代的烷基”中使用，所述烷基可以是被卤素原子（其可以是相同的或不同的）部分地或完全地取代的。“卤代烷基”或“被卤素取代的烷基”的实例包括 $\text{F}_3\text{C}-$ 、 ClCH_2- 、 CF_3CH_2- 和 CF_3CCl_2- 。术语“卤代环烷基”、“卤代烷氧基”、“卤代烷硫基”、“卤代烷基羰基”、“卤代烷氧基羰基”、“卤代烷基氨基羰基”、“卤代二烷基氨基羰基”等类似于术语“卤代烷基”进行定义。“卤代烷氧基”的实例包括 $\text{CF}_3\text{O}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 和 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}-$ 。“卤代烷硫基”的实例包括 $\text{CCl}_3\text{S}-$ 、 $\text{CF}_3\text{S}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}-$ 和 $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 。“卤代烷基亚磺酰基”的实例包括 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 和 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})-$ 。“卤代烷基磺酰基”的实例包括 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 和 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 。

[0087] 如本文所用的化学缩写 $\text{S}(\text{O})$ 和 $\text{S}(=\text{O})$ 表示亚磺酰基部分。如本文所用的化学缩写 SO_2 、 $\text{S}(\text{O})_2$ 和 $\text{S}(=\text{O})_2$ 表示磺酰基部分。如本文所用的化学缩写 $\text{C}(\text{O})$ 和 $\text{C}(=\text{O})$ 表示羰基部分。如本文所用的化学缩写 $\text{C}(\text{S})$ 和 $\text{C}(=\text{S})$ 表示硫代羰基部分。如本文所用的化学缩写 CO_2 、 $\text{C}(\text{O})\text{O}$ 和 $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ 表示氧基羰基部分。“CHO”意指甲酰基。

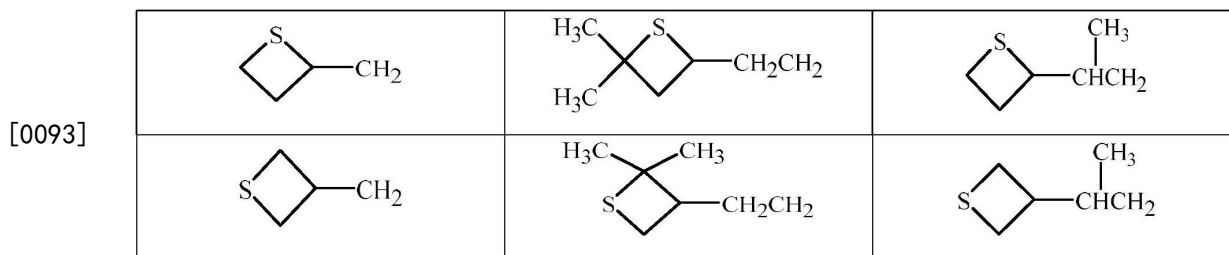
[0088] “氧杂环丙烷基烷基”表示直链或支链烷基上的氧杂环丙烷取代。“氧杂环丙烷基烷基”的实例包括但不限于



[0090] “氧杂环丁烷基烷基”表示直链或支链烷基上的氧杂环丁烷取代。“氧杂环丁烷基烷基”的实例包括但不限于



[0092] “硫杂环丁烷基烷基”表示直链或支链烷基上的硫杂环丁烷取代。“硫杂环丁烷基烷基”的实例包括但不限于



[0094] 在取代基中的碳原子的总数用“C_i-C_j”前缀表示,其中i和j是从1至9的数。例如,C₁-C₄烷基磺酰基表示甲基磺酰基至丁基磺酰基;C₂烷氧基烷基表示CH₃OCH₂-;C₃烷氧基烷基表示例如CH₃CH(OCH₃)-、CH₃OCH₂CH₂-或CH₃CH₂OCH₂-;并且C₄烷氧基烷基表示被含有总共四个碳原子的烷氧基取代的烷基的各种异构体,实例包括CH₃CH₂CH₂OCH₂-和CH₃CH₂OCH₂CH₂-。

[0095] 当化合物被带有下标(其指示所述取代基的数目可以超过1)的取代基取代时,所述取代基(当它们超过1时)独立地选自所定义的取代基的组,例如(R³)_m,其中m是0、1或2。当基团含有可以为氢的取代基,例如R²或R¹²时,则当该取代基为氢时,公认这等同于所述基团是未取代的。当显示出可变基团任选地附接到一个位置,例如(R³)_m其中m可以是0时,则氢可以位于该位置,即使在可变基团定义中没有提及。当基团上的一个或多个位置被称为是“没有被取代的”或“未被取代的”时,则附接氢原子以占据任何自由价。

[0096] 除非另外指明,否则作为式1的组分的“环”或“环体系”(例如,取代基Q¹)是碳环或杂环的。术语“环体系”表示两个或更多个稠环。术语“二环体系”和“稠合的二环体系”表示由两个稠环组成的环体系,该环体系可以是“邻位稠合的”、“桥接二环的”或“螺二环的”。“邻位稠合的二环体系”表示这样的环体系,其中两个组成环具有两个共同的邻近原子。“桥接的二环体系”是通过将一个或多个原子的链段与环的非邻近环成员键合而形成的。“螺二环体系”通过将两个或多个原子的链段键合至环的相同环成员而形成。术语“稠合杂二环体系”表示其中至少一个环原子不是碳的稠合二环体系。术语“环成员”是指形成环或环体系的骨架的原子或其他部分(例如,C(=O)、C(=S)、S(O)或S(O)₂)。

[0097] 术语“碳环(carbocyclic ring)”、“碳环(carbocycle)”或“碳环体系”表示其中形成环骨架的原子仅选自碳的环或环体系。术语“杂环(heterocyclic ring)”、“杂环(heterocycle)”或“杂环体系”表示其中至少一个形成环骨架的原子不是碳(例如,氮、氧或硫)的环或环体系。典型地,杂环含有不超过4个氮、不超过2个氧和不超过2个硫。除非另外指明,否则碳环或杂环可以是饱和或不饱和的环。“饱和的”是指具有由通过单键彼此连接的原子组成的骨架的环;除非另外指明,否则其余的原子价被氢原子占据。除非另外说明,否则“不饱和环”可以是部分不饱和的或完全不饱和的。表述“完全不饱和的环”意指原子的

环,其中在该环中的原子之间的键根据价键理论是单键或双键,并且此外该环中的原子之间的键包括尽可能多的双键,但没有累积双键(即没有 $C=C=C$ 或 $C=C=N$)。术语“部分不饱和的环”表示包含至少一个环成员通过双键键合到邻近环成员的环,并且在概念上可能在相邻环成员之间容纳大于存在的双键(即呈其部分不饱和形式)数量的多个非累积双键(即,呈其完全不饱和的对应形式)。

[0098] 除非另外指明,否则杂环和环体系可以通过任何可用的碳或氮通过替代在所述碳或氮上的氢来附接。

[0099] “芳族的”表示每个环原子基本上在相同的平面上且具有垂直于该环平面的p-轨道,并且其中 $(4n+2)$ 个 π 电子(其中n是正整数)与该环相关联以符合休克尔规则(Hückel's rule)。术语“芳族环体系”表示其中环体系中的至少一个环是芳族的碳环或杂环体系。当完全不饱和的碳环满足休克尔规则时,则所述环还被称为“芳族环”或“芳族碳环”。

[0100] 术语“芳族碳环体系”表示其中环体系中的至少一个环是芳族的碳环体系。当完全不饱和的杂环满足休克尔规则时,则所述环还被称为“杂芳族环”或“芳族杂环”。术语“芳族杂环体系”表示其中环体系中的至少一个环是芳族的杂环体系。术语“非芳族环体系”表示可以是完全饱和的、以及部分或完全不饱和的碳环或杂环体系,前提是环体系中的环都不是芳族的。术语“非芳族碳环体系”表示其中环体系中没有环是芳族的碳环。术语“非芳族杂环体系”表示其中环体系中没有环是芳族的杂环体系。

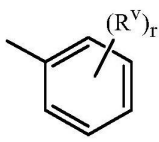
[0101] 与杂环有关的术语“任选地取代的”是指这样的基团,其为未被取代的或具有至少一个不消除由未被取代的类似物所拥有的生物活性的非氢取代基。如本文所使用的,除非另外指明,否则将应用下列定义。术语“任选地取代的”与短语“被取代或未被取代的”或与术语“(未)被取代的”可互换使用。除非另外指明,否则任选地取代的基团可在基团的每个可取代的位置处具有取代基,并且每个取代彼此独立。

[0102] 当取代基诸如 Q^2 或 Q^3 是5元或6元含氮杂环时,除非另外描述,否则其可通过任何可用的碳或氮环原子附接到式1的其余部分。如上所述, Q^2 或 Q^3 可以是(尤其)任选地被一个或多个选自如发明内容中所定义的取代基的组中的取代基取代的苯基。任选地被一至五个取代基取代的苯基的实例是如示例1中U-1所示的环,其中 R^v 是如发明内容中对 Q^2 和 Q^3 所定义的 R^9 ,并且r是从0至5的整数。

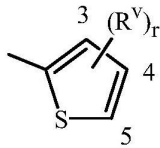
[0103] 如上所述, Q^2 或 Q^3 可以是(尤其)5元或6元杂环,其可以是饱和的或不饱和的,任选地被一个或多个选自如发明内容中定义的取代基的组中的取代基取代。任选地被一个或多个取代基取代的5元或6元不饱和芳族杂环的实例包括示例1中示出的环U-2至U-61,其中 R^v 是如发明内容中对 Q^2 和 Q^3 所定义的任何取代基(即, R^9),并且r是从0至4的整数,受限于每个U基团上可用位置的数目。由于U-29、U-30、U-36、U-37、U-38、U-39、U-40、U-41、U-42和U-43仅具有一个可用位置,所以对于这些U基团,r仅限于整数0或1,并且r为0意指U基团是未被取代的,并且氢存在于由 $(R^v)_r$ 所指示的位置处。

[0104] 示例1

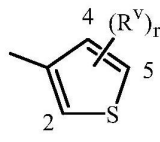
[0105]



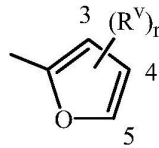
U-1



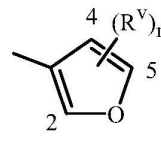
U-2



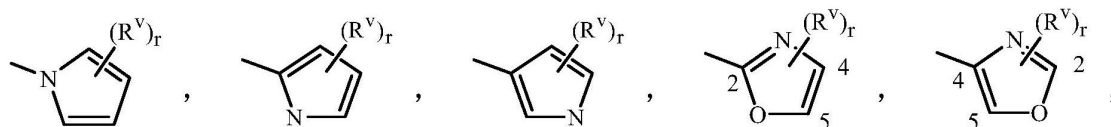
U-3



U-4



U-5



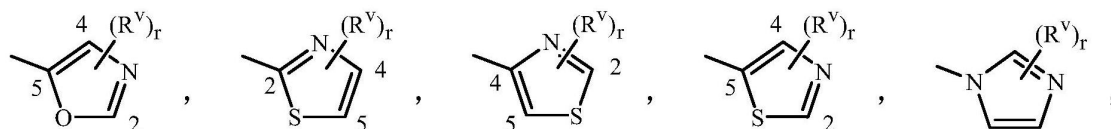
U-6

U-7

U-8

U-9

U-10



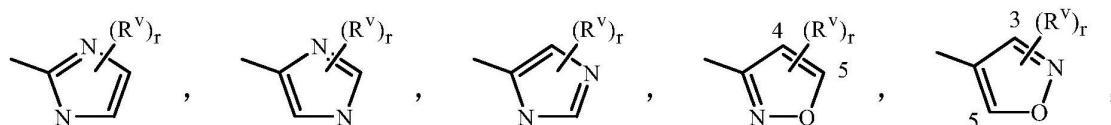
U-11

U-12

U-13

U-14

U-15



U-16

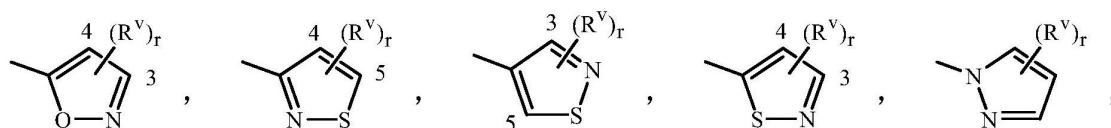
U-17

U-18

U-19

U-20

[0106]



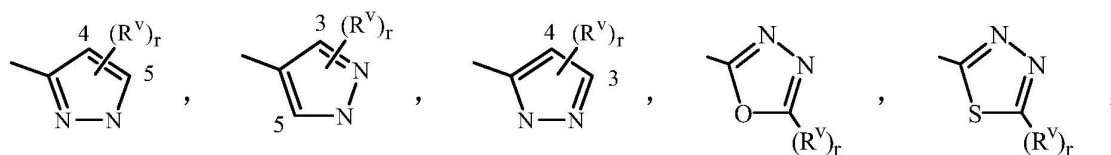
U-21

U-22

U-23

U-24

U-25



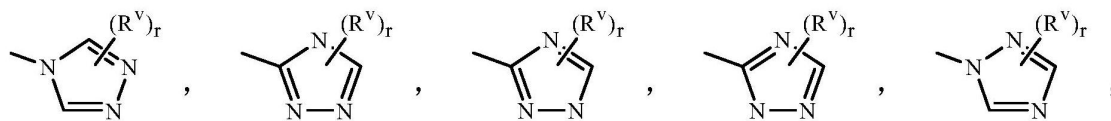
U-26

U-27

U-28

U-29

U-30



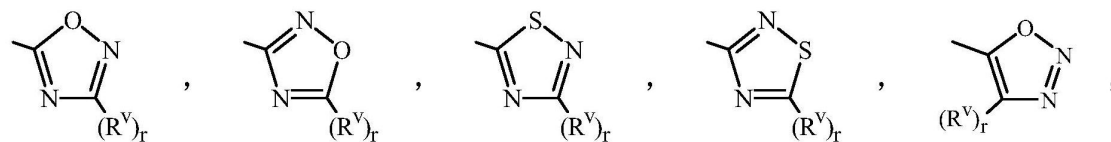
U-31

U-32

U-33

U-34

U-35



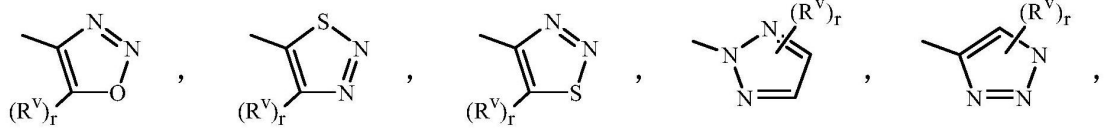
U-36

U-37

U-38

U-39

U-40



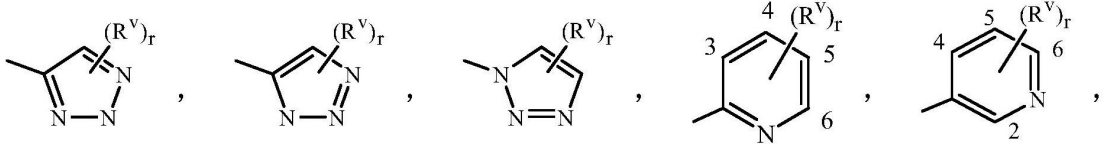
U-41

U-42

U-43

U-44

U-45



U-46

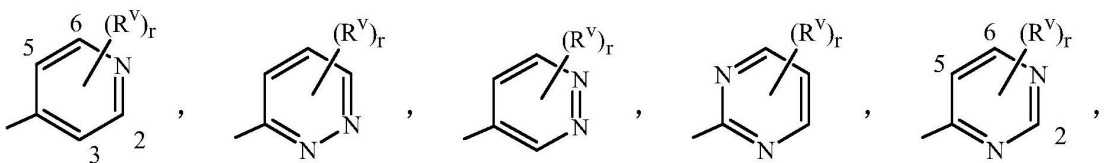
U-47

U-48

U-49

U-50

[0107]



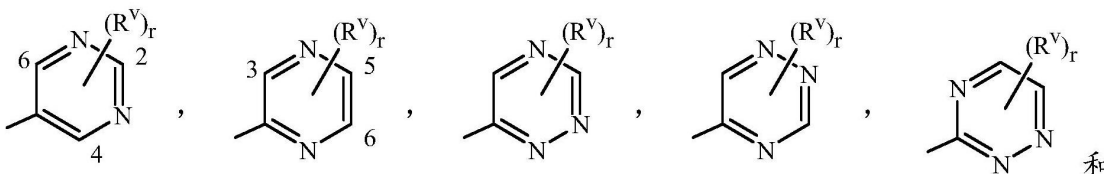
U-51

U-52

U-53

U-54

U-55



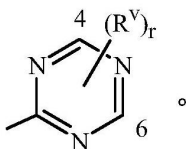
U-56

U-57

U-58

U-59

U-60



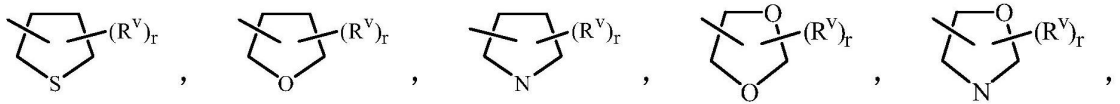
U-61

[0108] 应注意到,当 Q^2 是任选地被一个或多个选自如在发明内容中对 Q^2 定义的取代基的组中的取代基取代的3元或6元饱和或不饱和非芳族杂环时,杂环的一个或两个碳环成员可以任选地是羰基部分的氧化形式。

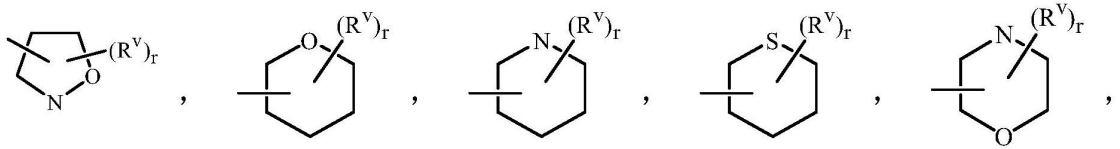
[0109] 5元或6元饱和或非芳族不饱和杂环的实例包括如示例2中所示的环T-1至T-35。应注意到,当T基团上的附接点示出为浮动时,T基团可以通过T基团的任何可用的碳或氮通过替换氢原子而附接到式1的其余部分。对应于 R^v 的任选的取代基可通过替换氢原子而附接到任何可用的碳或氮上。对于这些T环,r典型地为从0至4的整数,受限于每个T基团上可用位置的数目。

[0110] 注意,当 Q^1 、 Q^2 或 Q^3 包含选自T-28至T-35的环时, T^2 选自O、S或N。注意,当 T^2 为N时,氮原子可通过用H或对应于如发明内容中对 Q^1 、 Q^2 或 Q^3 所定义的 R^v 的取代基(即 R^8 或 R^9)取代来完成其化合价。

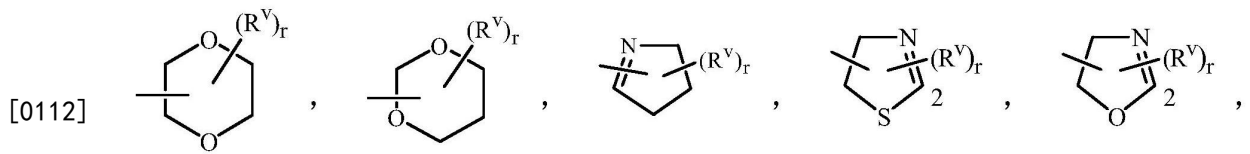
[0111] 示例2



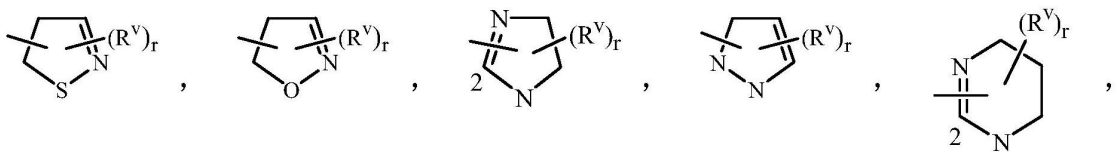
T-1 T-2 T-3 T-4 T-5



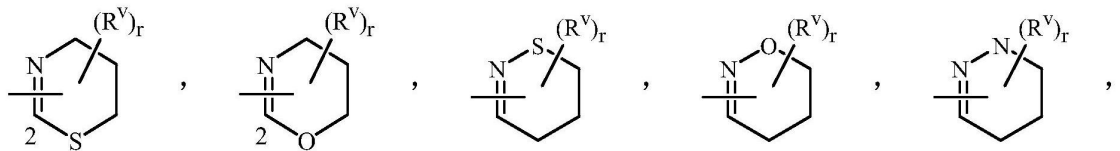
T-6 T-7 T-8 T-9 T-10



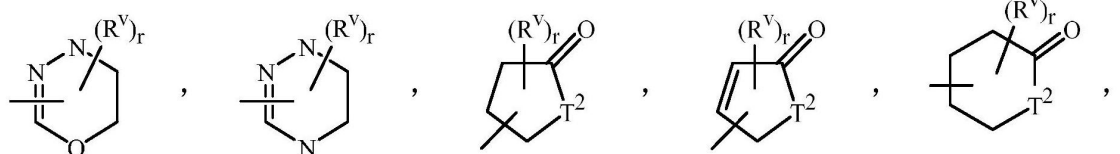
T-11 T-12 T-13 T-14 T-15



T-16 T-17 T-18 T-19 T-20

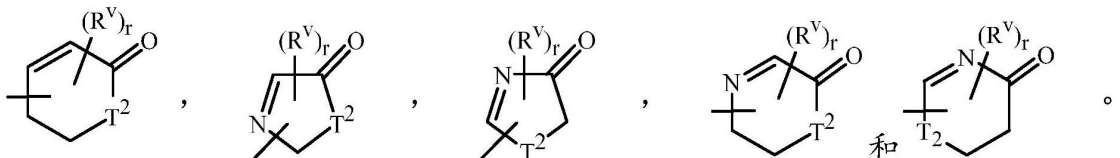


T-21 T-22 T-23 T-24 T-25



T-26 T-27 T-28 T-29 T-30

[0113]

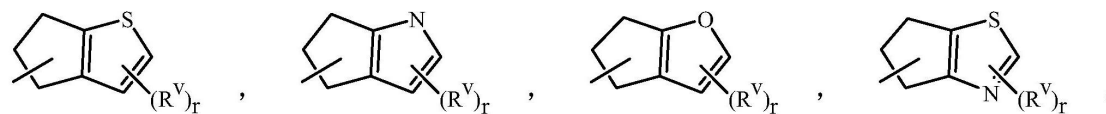


T-31 T-32 T-33 T-34 T-35

[0114] 如上所述, Q¹可以是(尤其)任选地被一个或多个选自如发明内容中所定义的取代

基的组中的取代基(即 R^8)取代的8、9或10元邻位稠合的二环体系。任选地被一个或多个取代基取代的8、9或10元邻位稠合的二环体系的实例包括示例3中示出的环U-81至U-123,其中 R^v 是如发明内容中对 Q^1 所定义的任何取代基(即 R^8),并且 r 典型地为从0至4的整数。

[0115] 示例3

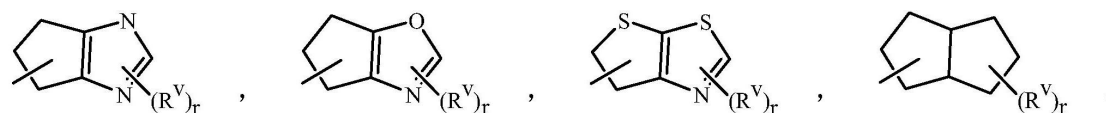


U-81

U-82

U-83

U-84



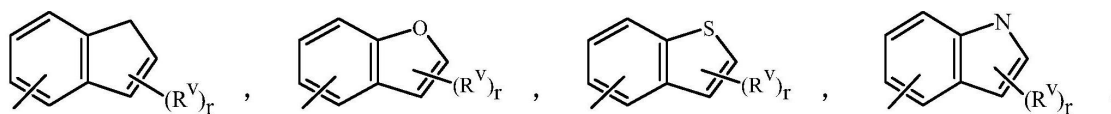
U-85

U-86

U-87

U-88

[0116]

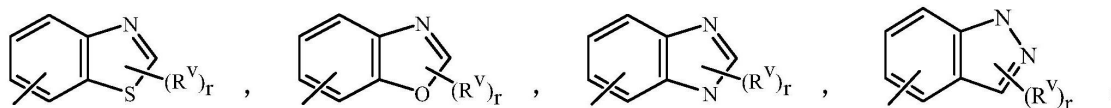


U-89

U-90

U-91

U-92

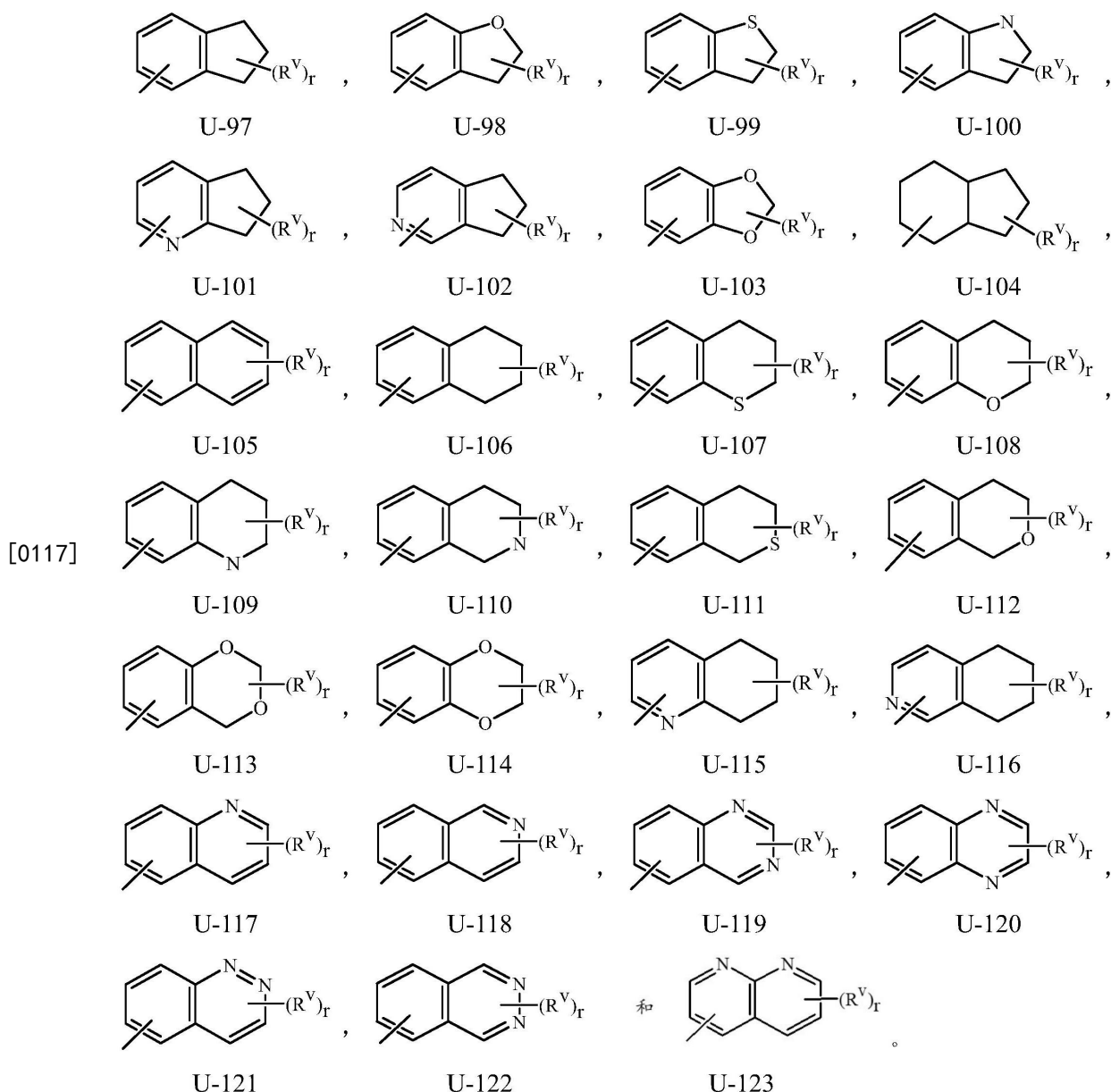


U-93

U-94

U-95

U-96



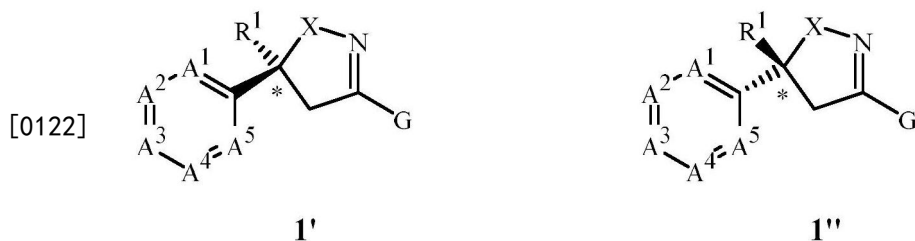
[0118] 虽然在结构U-1至U-123中示出 R^V 基团,但是应注意到,因为它们是任选的取代基,所以它们不必存在。应注意到,当 R^V 为H时,当附接到原子时,这如同所述原子一样是未取代的。需要取代以填充其化合价的氮原子被H或 R^V 取代。应注意到,当 $(R^V)_r$ 与U基团之间的附接点示出为浮动时, $(R^V)_r$ 可以附接到U基团的任何可用的碳原子或氮原子。应注意到,当U基团上的附接点示出为浮动时,U基团可以通过U基团的任何可用的碳或氮通过替换氢原子而附接到式1的其余部分。应注意到,一些U基团仅能被少于4个 R^V 基团取代(例如,U-2至U-5、U-7至U-48和U-52至U-61)。

[0119] 本领域中已知多种合成方法能够制备芳族和非芳族的杂环和环体系;对于广泛综述,参见Comprehensive Heterocyclic Chemistry[综合杂环化学],A.R.Katritzky和C.W.主编,Pergamon Press[培格曼出版社],牛津,1984的八卷集合和Comprehensive Heterocyclic Chemistry II[综合杂环化学II],A.R.Katritzky,C.W.Rees和E.F.V.Scriven主编,Pergamon Press[培格曼出版社],牛津,1996的十二卷集合。

[0120] 本披露的化合物可作为一种或多种立体异构体存在。立体异构体为构成相同但它

们的原子在空间中的排列不同的异构体,并且包括对映异构体、非对映异构体、顺-反异构体(还称为几何异构体)和阻转异构体。阻转异构体起因于围绕单键的旋转受限制,其中旋转势垒足够高以允许同分异构种类的分離。本领域的技术人员将理解,一种立体异构体当相对于一种或多种其他立体异构体富集时,或当与一种或多种其他立体异构体分离时,可能更有活性和/或可能表现出有益的效果。另外,本领域的技术人员知道如何分离、富集和/或选择性地制备所述立体异构体。对于立体异构现象的所有方面的综合讨论,参见Ernest L.Eliel和Samuel H.Wilen, Stereochemistry of Organic Compounds[有机化合物立体化学], John Wiley&Sons[约翰威立父子出版社],1994。

[0121] 本披露的化合物可以作为立体异构体的混合物或单独的立体异构体存在。例如,式1的两种可能的对映异构体被描述为式1'和式1''涉及用星号(*)标识的异噁唑啉手性中心。类似地,在例如R⁵处可能有其他手性中心。



[0123] 本文绘制的分子描述依照用于描绘立体化学的标准惯例。为了指明立体构型,从绘图平面伸出并且朝向观看者的键以实心楔形表示,其中该楔形的宽端连接至从绘图平面伸出朝向观看者的原子上。伸向绘图平面下方并且远离观察者的键由虚线楔形表示,其中该楔形的窄端连接到进一步远离观察者的原子上。

[0124] 由于式1中可能存在手性碳原子,本披露的化合物可以作为立体异构体存在。因此,本披露包括式1的化合物的单独的立体异构体,以及式1的化合物的立体异构体的混合物。

[0125] 本披露的化合物由于围绕式1中的酰胺键的旋转受限,因此可以作为一种或多种构象异构体存在。本披露包括构象异构体的混合物。此外,本披露包括一种构象异构体相对于其他构象异构体富集的化合物。

[0126] 本披露包括外消旋混合物,例如等量的式1'和1''的对映异构体。此外,本披露包括与式1的对映异构体中的外消旋混合物相比富集的化合物。还包括式1(例如式1'和1'')的化合物的基本上纯的对映异构体。

[0127] 当对映异构体地富集时,一种对映异构体以比另一种更大的量存在,并且富集程度可以通过定义为(2x-1)·100%的对映异构体过量(“ee”)的表达来定义,其中x是混合物中占优势的对映异构体的摩尔分数(例如,20%的ee对应于对映异构体的60:40比率)。优选地,本披露的组合物具有更具活性异构体的至少50%的对映异构体过量;更优选地至少75%的对映异构体过量;还更优选地至少90%的对映异构体过量;并且最优选地至少94%的对映异构体过量。特别值得注意的是更具活性的异构体的对映异构体纯的实施例。

[0128] 本领域的技术人员将理解,不是所有的含氮杂环都可以形成N-氧化物,因为氮需要可用的孤电子对以氧化成氧化物;本领域的技术人员将认识到可形成N-氧化物的那些含氮杂环。本领域技术人员还将认识到叔胺能够形成N-氧化物。用于制备杂环和叔胺的N-氧化物的合成方法是本领域的技术人员非常熟知的,包括使用过氧酸诸如过氧乙酸和3-氯过

氧苯甲酸 (MCPBA)、过氧化氢、烷基氢过氧化物诸如叔丁基氢过氧化物、过硼酸钠和二环氧乙烷诸如二甲基二环氧乙烷来氧化杂环和叔胺。用于制备N-氧化物的这些方法已广泛描述和综述于文献中,参见例如:T.L.Gilchrist, *Comprehensive Organic Synthesis* [综合有机合成], 第7卷, 第748-750页, S.V.Ley编辑, Pergamon Press [培格曼出版社]; M.Tisler和B.Stanovnik, *Comprehensive Heterocyclic Chemistry* [综合杂环化学], 第3卷, 第18-20页, A.J.Boulton和A.McKillop编辑, 培格曼出版社; M.R.Grimmett和B.R.T.Keene, *Advances in Heterocyclic Chemistry* [杂环化学进展], 第43卷, 第149-161页, A.R.Katritzky编辑, Academic Press [学术出版社]; M.Tisler和B.Stanovnik, *Advances in Heterocyclic Chemistry* [杂环化学进展], 第9卷, 第285-291页, A.R.Katritzky和A.J.Boulton编辑, 学术出版社; 和G.W.H.Cheeseman和E.S.G.Werstiuk, *Advances in Heterocyclic Chemistry* [杂环化学进展], 第22卷, 第390-392页, A.R.Katritzky和A.J.Boulton编辑, 学术出版社。

[0129] 本领域的技术人员认识到, 由于在环境中和在生理条件下化合物的盐与它们相应的非盐形式处于平衡, 因此盐共享非盐形式的生物效用。因此, 多种式1的化合物的盐可用于防治无脊椎有害生物。式1的化合物的盐包括与无机酸或有机酸形成的酸加成盐, 这些酸诸如氢溴酸、盐酸、硝酸、磷酸、硫酸、乙酸、丁酸、富马酸、乳酸、马来酸、丙二酸、草酸、丙酸、水杨酸、酒石酸、4-甲苯磺酸或戊酸。当式1的化合物包含酸性部分诸如羧酸或酚时, 盐还包括与有机碱或无机碱形成的那些, 这些碱诸如吡啶、三乙胺或氨、或钠、钾、锂、钙、镁或钡的酰胺、氢化物、氢氧化物或碳酸盐。因此, 本披露包括选自式1的化合物、其N-氧化物和合适的盐。

[0130] 选自式1的化合物、其立体异构体、互变异构体、N-氧化物和盐典型地以多于一种形式存在, 并且因此式1包括式1所代表的化合物的所有结晶和非结晶形式。非结晶形式包括为固体的实施例诸如蜡和树胶, 以及为液体的实施例诸如溶液和熔融物。结晶形式包括代表基本上单晶类型的实施例和代表多晶型物(即不同结晶类型)的混合物的实施例。术语“多晶型物”是指可以以不同晶型结晶的化合物的具体结晶形式, 这些形式在晶格中具有不同的分子排列和/或构象。虽然多晶型物可具有相同的化学组成, 但是它们也可以在组成上由于共结晶水或其他分子的存在或不存在而不同, 该共结晶水或其他分子可弱结合或强结合在晶格内。多晶型物可以在此类化学、物理、和生物特性方面不同, 诸如晶体形状、密度、硬度、颜色、化学稳定性、熔点、吸湿性、可悬浮性、溶解速率和生物利用度。本领域的技术人员将理解, 相对于由式1表示的相同化合物的另一种多晶型物或多晶型物的混合物, 由式1表示的化合物的多晶型物可以展现出有益效果(例如适合制备有用制剂, 改善的生物学性能)。由式1表示的化合物的具体多晶型物的制备和分离可通过本领域技术人员已知的方法实现, 包括例如采用所选溶剂和温度的结晶。本披露的化合物可作为一种或多种结晶多晶型物存在。本披露包含单独多晶型物和多晶型物的混合物二者, 包括相对于其他富集多晶型物一种多晶型物的混合物。对于多晶型现象的综合讨论, 参见R.Hilfiker编辑, *Polymorphism in the Pharmaceutical Industry* [制药工业的多晶型现象], Wiley-VCH, Weinheim [魏因海姆], 2006。

[0131] 本披露的如发明内容中所描述的实施例包括以下描述的那些。在以下实施例中, 除非在实施例中进一步定义, 否则式1包括其立体异构体、N-氧化物和盐, 并且对“式1的化

合物”的提及包括在发明内容中指定的取代基的定义。

[0132] 实施例1. 一种式1的化合物, 其中G是G-1。

[0133] 实施例1a. 一种式1的化合物, 其中G是G-2。

[0134] 实施例2. 如实施例1或1a所述的化合物, 其中, A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 和 A^5 独立地是 CR^2 。

[0135] 实施例2a. 如实施例2所述的化合物, 其中 A^1 和 A^5 是CH。

[0136] 实施例3. 如实施例1或1a所述的化合物, 其中 A^1 是N; 并且 A^2 、 A^3 、 A^4 和 A^5 独立地是 CR^2 。

[0137] 实施例3a. 如实施例1或1a所述的化合物, 其中 A^2 是N; 并且 A^1 、 A^3 、 A^4 和 A^5 独立地是 CR^2 。

[0138] 实施例3b. 如实施例1或1a所述的化合物, 其中 A^3 是N; 并且 A^1 、 A^2 、 A^4 和 A^5 独立地是 CR^2 。

[0139] 实施例4. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, X是O或 CH_2 。

[0140] 实施例4a. 如实施例4所述的化合物, 其中X是O。

[0141] 实施例4b. 如实施例4所述的化合物, 其中X是 CH_2 。

[0142] 实施例5. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, X^1 和 X^2 各自独立地是N或 CR^3 。

[0143] 实施例5a. 如实施例5所述的化合物, 其中 X^1 和 X^2 各自独立地是 CR^3 。

[0144] 实施例5b. 如实施例5a所述的化合物, 其中 X^1 和 X^2 是CH。

[0145] 实施例6. 如实施例5所述的化合物, 其中 X^1 是N; 并且 X^2 是 CR^3 。

[0146] 实施例6a. 如实施例5所述的化合物, 其中 X^2 是N; 并且 X^1 是 CR^3 。

[0147] 实施例7. 如实施例5所述的化合物, 其中 X^1 和 X^2 是N。

[0148] 实施例8. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, R^1 是 C_1 - C_2 氟烷基。

[0149] 实施例8a. 如实施例8所述的化合物, 其中 R^1 是 CF_3 、 CHF_2 、 CH_2F 、 CH_2CHF_2 或 CH_2CF_3 。

[0150] 实施例8b. 如实施例8所述的化合物, 其中 R^1 是 CF_3 。

[0151] 实施例9. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, 每个 R^2 独立地是H、卤素、-CN、- NO_2 、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_2 烷硫基、 C_1 - C_2 卤代烷硫基、 C_1 - C_2 烷基亚磺酰基、 C_1 - C_2 卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_2 烷基磺酰基或 C_1 - C_2 卤代烷基磺酰基。

[0152] 实施例9a. 如实施例9所述的化合物, 其中, 每个 R^2 独立地是H、卤素、-CN、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基。

[0153] 实施例9b. 如实施例9所述的化合物, 其中, 每个 R^2 独立地是H、卤素、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 卤代烷氧基。

[0154] 实施例9c. 如实施例9所述的化合物, 其中每个 R^2 独立地是H、卤素或 C_1 - C_2 卤代烷基。

[0155] 实施例9d. 如实施例9所述的化合物, 其中每个 R^2 独立地是H、卤素或 C_1 - C_2 卤代烷氧基。

[0156] 实施例9e. 如实施例9所述的化合物, 其中每个 R^2 独立地是H或卤素。

[0157] 实施例10. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, 每个 R^3 独立地是H、卤素、-CN、- NO_2 、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 -

C₄卤代烷基硫基、C₁-C₄烷基亚磺酰基、C₁-C₄卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄烷基磺酰基或C₁-C₄卤代烷基磺酰基。

[0158] 实施例10a. 如实施例10所述的化合物, 其中, 每个R³独立地是H、卤素、-CN、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₁-C₄烷氧基或C₁-C₄卤代烷氧基。

[0159] 实施例10b. 如实施例10所述的化合物, 其中, 每个R³独立地是H、卤素、C₁-C₂烷基、C₁-C₂卤代烷基、C₁-C₂烷氧基或C₁-C₂卤代烷氧基。

[0160] 实施例10c. 如实施例10所述的化合物, 其中每个R³独立地是H、卤素或C₁-C₂卤代烷基。

[0161] 实施例10d. 如实施例10所述的化合物, 其中每个R³独立地是H、卤素或C₁-C₂卤代烷氧基。

[0162] 实施例10e. 如实施例10所述的化合物, 其中每个R³独立地是H或卤素。

[0163] 实施例10f. 如实施例10所述的化合物, 其中R³是H。

[0164] 实施例11. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, m是0、1或2。

[0165] 实施例11a. 如实施例11所述的化合物, 其中m是2。

[0166] 实施例11b. 如实施例11所述的化合物, 其中m是0或1。

[0167] 实施例11c. 如实施例11所述的化合物, 其中m是0。

[0168] 实施例11d. 如实施例11所述的化合物, 其中m是1。

[0169] 实施例12. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, J是C(=Z)NR⁴R⁵。

[0170] 实施例13. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, J是CH(R⁶)N(R¹³)C(=Z)R¹⁴。

[0171] 实施例14. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, Z独立地是O或S。

[0172] 实施例14a. 如实施例12所述的化合物, 其中Z是O。

[0173] 实施例14b. 如实施例12所述的化合物, 其中Z是S。

[0174] 实施例14c. 如实施例13所述的化合物, 其中Z是O。

[0175] 实施例14d. 如实施例13所述的化合物, 其中Z是S。

[0176] 实施例15. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, R⁴是H、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₆环烷基、C₄-C₇烷基环烷基、C₄-C₇环烷基烷基、C₂-C₇烷基羰基或C₂-C₇烷氧基羰基。

[0177] 实施例15a. 如实施例15所述的化合物, 其中, R⁴是H、C₁-C₆烷基、C₄-C₇烷基环烷基、C₄-C₇环烷基烷基、C₂-C₇烷基羰基或C₂-C₇烷氧基羰基。

[0178] 实施例15b. 如实施例15所述的化合物, 其中, R⁴是H、C₁-C₄烷基、C₂-C₇烷基羰基或C₂-C₇烷氧基羰基。

[0179] 实施例15c. 如实施例15所述的化合物, 其中, R⁴是H、C₂-C₇烷基羰基或C₂-C₇烷氧基羰基。

[0180] 实施例15d. 如实施例15所述的化合物, 其中, R⁴是C₁-C₄烷基、C₂-C₇烷基羰基或C₂-C₇烷氧基羰基。

[0181] 实施例15e. 如实施例15所述的化合物, 其中R⁴是H。

[0182] 实施例16. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, R⁵是H、OR¹⁰、NR¹¹R¹²、SO₂NR¹¹R¹²、C(R¹²)=NOR¹¹、CHR¹²NHR¹¹或Q¹; 或C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₆环烷基、

C₄-C₇烷基环烷基或C₄-C₇环烷基烷基,各自任选地被一个或多个独立地选自R⁷的取代基取代。

[0183] 实施例16a.如实施例16所述的化合物,其中,R⁵是OR¹⁰、NR¹¹R¹²、SO₂NR¹¹R¹²、C(R¹²)=NOR¹¹或Q¹。

[0184] 实施例16b.如实施例16所述的化合物,其中R⁵是H,CHR¹²NHR¹¹;或C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₆环烷基、C₄-C₇烷基环烷基或C₄-C₇环烷基烷基,各自任选地被一个或多个独立地选自R⁷的取代基取代。

[0185] 实施例16c.如实施例16所述的化合物,其中R⁵是CHR¹²NHR¹¹;或C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₆环烷基、C₄-C₇烷基环烷基或C₄-C₇环烷基烷基,各自任选地被一个或多个独立地选自R⁷的取代基取代。

[0186] 实施例16d.如实施例16所述的化合物,其中,R⁵是C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₆环烷基或C₄-C₇烷基环烷基,各自任选地被一个或多个独立地选自R⁷的取代基取代。

[0187] 实施例16e.如实施例16所述的化合物,其中R⁵是CHR¹²NHR¹¹;或C₁-C₄烷基、C₃-C₆环烷基、或C₄-C₇环烷基烷基,各自任选地被一个或多个独立地选自R⁷的取代基取代。

[0188] 实施例16f.如实施例16所述的化合物,其中,R⁵是环丙基、环丙基甲基或-CH(CH₃)C(=O)NH₂,各自任选地被一个或多个独立地选自R⁷的取代基取代。

[0189] 实施例16g.如实施例16所述的化合物,其中,R⁵是环丙基、环丙基甲基或-CH(CH₃)C(=O)NH₂。

[0190] 实施例16h.如实施例16所述的化合物,其中R⁵是环丙基。

[0191] 实施例16i.如实施例16所述的化合物,其中R⁵是环丙基甲基。

[0192] 实施例16j.如实施例16所述的化合物,其中R⁵是CH(CH₃)C(=O)NH₂。

[0193] 实施例16k.如实施例16所述的化合物,其中R⁵是H。

[0194] 实施例17.如前述实施例中任一项所述的式1的化合物,其中,R⁴和R⁵连同它们所附接的氮一起形成3元至6元环,该环含有选自碳原子和最高达一个独立地选自N、S和O的另外原子的环成员,所述环任选地被1至4个独立地选自以下各项的取代基取代:卤素、C₁-C₂烷基、C₁-C₂卤代烷基、C₁-C₂烷氧基、C₁-C₂卤代烷氧基、-CN和-NO₂。

[0195] 实施例17a.如实施例17所述的化合物,其中,R⁴和R⁵连同它们所附接的氮一起形成3元至6元环,该环含有选自碳原子和最高达一个独立地选自N、S和O的另外原子的环成员,所述环任选地被1至2个独立地选自以下各项的取代基取代:卤素、C₁-C₂烷基、C₁-C₂卤代烷基、C₁-C₂烷氧基、C₁-C₂卤代烷氧基、-CN和-NO₂。

[0196] 实施例17b.如实施例17所述的化合物,其中,R⁴和R⁵连同它们所附接的氮一起形成3元至6元环,该环含有选自碳原子和最高达一个独立地选自N、S和O的另外原子的环成员,所述环任选地被1至2个独立地选自以下各项的取代基取代:卤素、C₁-C₂烷基和C₁-C₂卤代烷基。

[0197] 实施例17c.如实施例17所述的化合物,其中,R⁴和R⁵连同它们所附接的氮一起形成3元至5元环,该环含有选自碳原子和最高达一个独立地选自N、S和O的另外原子的环成员,所述环任选地被1至2个独立地选自以下各项的取代基取代:卤素、C₁-C₂烷基和C₁-C₂卤代烷基。

[0198] 实施例18.如前述实施例中任一项所述的式1的化合物,其中,R⁶是H、卤素、-CN、C₁-

C₃烷基或C₁-C₃卤代烷基。

[0199] 实施例18a. 如实施例18所述的化合物, 其中R⁶是H、C₁-C₃烷基或C₁-C₃卤代烷基。

[0200] 实施例18b. 如实施例18所述的化合物, 其中R⁶是H。

[0201] 实施例19. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, 每个R⁷独立地是卤素、C₁-C₆烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆烷基亚磺酰基、C₁-C₆烷基磺酰基、C₁-C₆烷基氨基、C₂-C₈二烷基氨基、C₃-C₆环烷基氨基、C₂-C₇烷基羰基、C₂-C₇烷氧基羰基、C₂-C₇烷基氨基羰基、C₃-C₇环烷基氨基羰基、C₃-C₇烯基氨基羰基、C₃-C₇炔基氨基羰基、C₃-C₉二烷基氨基羰基、C₂-C₇卤代烷基羰基、C₂-C₇卤代烷氧基羰基、C₂-C₇卤代烷基氨基羰基、C₃-C₉卤代二烷基氨基羰基、羟基、-NH₂、-CN、-CONH₂、-NO₂或Q²。

[0202] 实施例19a. 如实施例19所述的化合物, 其中, 每个R⁷独立地是卤素、C₁-C₆烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆烷基亚磺酰基、C₁-C₆烷基磺酰基、-CN或Q²。

[0203] 实施例19b. 如实施例19所述的化合物, 其中每个R⁷独立地是卤素、C₁-C₄烷基或C₁-C₄烷氧基。

[0204] 实施例19c. 如实施例19所述的化合物, 其中每个R⁷独立地是C₁-C₆烷基亚磺酰基、C₁-C₆烷基磺酰基。

[0205] 实施例19d. 如实施例19所述的化合物, 其中每个R⁷独立地是C₁-C₄烷基或C₁-C₄烷氧基。

[0206] 实施例20. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, Q¹是5元或6元芳族环或4元至11元部分不饱和环或环体系, 其任选地含有最高达三个选自最高达1个氧、最高达1个硫和最高达3个氮的杂原子, 其中最高达2个碳原子环成员独立地选自C(=O)和C(=S)并且该硫原子环成员选自S、S(=O)和S(=O)₂, 每个环或环体系任选地被一个或多个独立地选自R⁸的取代基取代。

[0207] 实施例20a. 如实施例20所述的化合物, 其中, Q¹是5元或6元芳族环, 其任选地含有最高达三个选自最高达1个氧、最高达1个硫和最高达3个氮的杂原子, 每个环任选地被一个或多个独立地选自R⁸的取代基取代。

[0208] 实施例20b. 如实施例20所述的化合物, 其中, Q¹是5元或6元芳族环, 其任选地含有最高达三个选自最高达1个氧、最高达1个硫和最高达2个氮的杂原子, 每个环任选地被一个或多个独立地选自R⁸的取代基取代。

[0209] 实施例20c. 如实施例20所述的化合物, 其中, Q¹是4元至11元部分不饱和环或环体系, 其任选地含有最高达三个选自最高达1个氧、最高达1个硫和最高达3个氮的杂原子, 每个环或环体系任选地被一个或多个独立地选自R⁸的取代基取代。

[0210] 实施例20d. 如实施例20所述的化合物, 其中, Q¹是4元至6元部分不饱和环, 其任选地含有最高达三个选自最高达1个氧、最高达1个硫和最高达3个氮的杂原子, 每个环任选地被一个或多个独立地选自R⁸的取代基取代。

[0211] 实施例21. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, 每个Q²独立地是苯环、5元或6元芳族杂环或3元至6元非芳族杂环, 每个环任选地被一个或多个独立地选自R⁹的取代基取代。

[0212] 实施例21a. 如实施例21所述的化合物, 其中每个Q²独立地是任选地被一个或多个独立地选自R⁹的取代基取代的苯环。

[0213] 实施例21b.如实施例21所述的化合物,其中,每个 Q^2 是5元或6元芳族杂环,每个环任选地被一个或多个独立地选自 R^9 的取代基取代。

[0214] 实施例21c.如实施例21所述的化合物,其中,每个 Q^2 独立地是3元至6元非芳族杂环,每个环任选地被一个或多个独立地选自 R^9 的取代基取代。

[0215] 实施例22.如前述实施例中任一项所述的式1的化合物,其中,每个 R^8 独立地是卤素、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 卤代烷硫基、 C_1-C_6 烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 烷基磺酰基、 C_1-C_6 卤代烷基磺酰基、 C_1-C_6 烷基氨基、 C_2-C_6 二烷基氨基、 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_2-C_7 烷基氨基羰基、 C_3-C_9 二烷基氨基羰基、-CN或- NO_2 。

[0216] 实施例22a.如实施例22所述的化合物,其中每个 R^8 独立地是卤素、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基或-CN。

[0217] 实施例22b.如实施例22所述的化合物,其中每个 R^8 独立地是卤素、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基或-CN。

[0218] 实施例22c.如实施例22所述的化合物,其中每个 R^8 独立地是卤素、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 卤代烷氧基或-CN。

[0219] 实施例23.如前述实施例中任一项所述的式1的化合物,其中,每个 R^9 独立地是卤素、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 卤代烷硫基、 C_1-C_6 烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 烷基磺酰基、 C_1-C_6 卤代烷基磺酰基、 C_1-C_6 烷基氨基、 C_2-C_6 二烷基氨基、-CN、- NO_2 、苯基或吡啶基。

[0220] 实施例23a.如实施例23所述的化合物,其中每个 R^9 独立地是卤素、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基或-CN。

[0221] 实施例23b.如实施例23所述的化合物,其中每个 R^9 独立地是卤素、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基或-CN。

[0222] 实施例23c.如实施例23所述的化合物,其中每个 R^9 独立地是卤素、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 卤代烷氧基或-CN。

[0223] 实施例24.如前述实施例中任一项所述的式1的化合物,其中, R^{10} 是H;或 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 环烷基、 C_4-C_7 烷基环烷基或 C_4-C_7 环烷基烷基,各自任选地被一个或多个卤素取代。

[0224] 实施例24a.如实施例24所述的化合物,其中 R^{10} 是H;或 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_4-C_7 烷基环烷基或 C_4-C_7 环烷基烷基,各自任选地被一个或多个卤素取代。

[0225] 实施例24b.如实施例24所述的化合物,其中 R^{10} 是H;或 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_4-C_7 烷基环烷基或 C_4-C_7 环烷基烷基,各自任选地被一至三个卤素取代。

[0226] 实施例24c.如实施例24所述的化合物,其中, R^{10} 是 C_3-C_6 环烷基、 C_4-C_7 烷基环烷基或 C_4-C_7 环烷基烷基,各自任选地被一至三个卤素取代。

[0227] 实施例24d.如实施例24所述的化合物,其中 R^{10} 是H;或任选地被一至三个卤素取代的 C_1-C_6 烷基。

[0228] 实施例25.如前述实施例中任一项所述的式1的化合物,其中, R^{11} 是H、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 环烷基、 C_4-C_7 烷基环烷基、 C_4-C_7 环烷基烷基、 C_2-C_7 烷基羰基、 C_2-C_7 卤代烷基羰基或 C_2-C_7 烷氧基羰基。

[0229] 实施例25a. 如实施例25所述的化合物, 其中, R^{11} 是H、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_7 烷基环烷基或 C_4 - C_7 环烷基烷基。

[0230] 实施例25b. 如实施例25所述的化合物, 其中, R^{11} 是H、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_7 烷基羰基、 C_2 - C_7 卤代烷基羰基或 C_2 - C_7 烷氧基羰基。

[0231] 实施例25c. 如实施例25所述的化合物, 其中, R^{11} 是H、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_5 烷基羰基、 C_2 - C_5 卤代烷基羰基或 C_2 - C_5 烷氧基羰基。

[0232] 实施例25d. 如实施例25所述的化合物, 其中 R^{11} 是H。

[0233] 实施例26. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, R^{12} 是H或 Q^3 ; 或 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_7 烷基环烷基或 C_4 - C_7 环烷基烷基, 各自任选地被一个或多个独立地选自 R^7 的取代基取代。

[0234] 实施例26a. 如实施例26所述的化合物, 其中 R^{12} 是任选地被一个或多个独立地选自 R^7 的取代基取代的 Q^3 。

[0235] 实施例26b. 如实施例26所述的化合物, 其中 R^{12} 是H; 或 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_7 烷基环烷基或 C_4 - C_7 环烷基烷基, 各自任选地被一个或多个独立地选自 R^7 的取代基取代。

[0236] 实施例26c. 如实施例26所述的化合物, 其中 R^{12} 是H; 或 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_6 环烷基, 各自任选地被一至三个独立地选自 R^7 的取代基取代。

[0237] 实施例26d. 如实施例26所述的化合物, 其中 R^{12} 是H; 或 C_1 - C_4 烷基, 各自任选地被一至三个独立地选自 R^7 的取代基取代。

[0238] 实施例26e. 如实施例26所述的化合物, 其中 R^{12} 是 C_1 - C_4 烷基。

[0239] 实施例27. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, R^{11} 和 R^{12} 连同它们所附接的氮一起形成3元至6元环, 该环含有选自碳原子和最高达一个独立地选自氮、硫和氧的另外原子的环成员, 其中该硫原子环成员选自S、S(=O)和S(=O)₂, 所述环任选地被1至4个独立地选自以下各项的取代基取代: 卤素、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷基、 C_1 - C_2 烷氧基、 C_1 - C_2 卤代烷氧基、-CN和-NO₂。

[0240] 实施例27a. 如实施例27所述的化合物, 其中, R^{11} 和 R^{12} 连同它们所附接的氮一起形成3元至6元环, 该环含有选自碳原子和最高达一个独立地选自氮、硫和氧的另外原子的环成员, 所述环任选地被1至2个独立地选自以下各项的取代基取代: 卤素、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷基、 C_1 - C_2 烷氧基、 C_1 - C_2 卤代烷氧基、-CN和-NO₂。

[0241] 实施例27b. 如实施例27所述的化合物, 其中, R^{11} 和 R^{12} 连同它们所附接的氮一起形成3元至6元环, 该环含有选自碳原子和最高达一个独立地选自氮、硫和氧的另外原子的环成员, 所述环任选地被1至2个独立地选自以下各项的取代基取代: 卤素、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 卤代烷基。

[0242] 实施例27c. 如实施例27所述的化合物, 其中, R^{11} 和 R^{12} 连同它们所附接的氮一起形成3元至5元环, 该环含有选自碳原子和最高达一个独立地选自氮、硫和氧的另外原子的环成员, 所述环任选地被1至2个独立地选自以下各项的取代基取代: 卤素、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 卤代烷基。

[0243] 实施例28. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, Q^3 是苯环或5元或6元杂环, 每个环任选地被一个或多个独立地选自 R^9 的取代基取代。

[0244] 实施例28a. 如实施例28所述的化合物, 其中 Q^3 是任选地被一至三个独立地选自 R^9 的取代基取代的苯环。

[0245] 实施例28b. 如实施例28所述的化合物, 其中 Q^3 是任选地被一至三个独立地选自 R^9 的取代基取代的5元或6元杂环。

[0246] 实施例29. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, R^{13} 是H、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_7 烷基羰基、 C_2-C_4 卤代烷基羰基、 C_2-C_7 烷氧基羰基或 C_2-C_4 烷氧基烷基。

[0247] 实施例29a. 如实施例29所述的化合物, 其中 R^{13} 是H、 C_1-C_6 烷基或 C_2-C_4 烷氧基烷基。

[0248] 实施例29b. 如实施例29所述的化合物, 其中 R^{13} 是H、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_7 烷基羰基或 C_2-C_7 烷氧基羰基。

[0249] 实施例29c. 如实施例29所述的化合物, 其中 R^{13} 是H、 C_2-C_7 烷基羰基或 C_2-C_7 烷氧基羰基。

[0250] 实施例29d. 如实施例29所述的化合物, 其中 R^{13} 是H。

[0251] 实施例30. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, R^{14} 是任选地被卤素取代的 C_1-C_6 烷基。

[0252] 实施例30a. 如实施例30所述的化合物, 其中, R^{14} 是任选地被卤素取代的 C_1-C_4 烷基。

[0253] 实施例30b. 如实施例30所述的化合物, 其中 R^{14} 是甲基或乙基。

[0254] 实施例31. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, R^{14} 是任选地被 OR^{19} 取代的 C_1-C_6 烷基。

[0255] 实施例32. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, R^{14} 是任选地被 $S(=O)_n R^{20}$ 取代的 C_1-C_6 烷基。

[0256] 实施例33. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, R^{14} 是任选地被 $NR^{21}C(=O)R^{22}$ 取代的 C_1-C_6 烷基。

[0257] 实施例34. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, R^{14} 是 C_3-C_6 环烷基或 C_4-C_7 环烷基烷基, 各自任选地被最高达一个环丙基和最高达4个选自卤素、-CN、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 卤代烷基的取代基取代。

[0258] 实施例34a. 如实施例34所述的化合物, 其中, R^{14} 是 C_3-C_6 环烷基或 C_4-C_7 环烷基烷基, 各自任选地被最高达一个环丙基和最高达2个选自卤素、-CN、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 卤代烷基的取代基取代。

[0259] 实施例34b. 如实施例34所述的化合物, 其中, R^{14} 是 C_3-C_6 环烷基或 C_4-C_7 环烷基烷基, 各自任选地被最高达2个选自卤素、-CN、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 卤代烷基的取代基取代。

[0260] 实施例34c. 如实施例34所述的化合物, 其中, R^{14} 是 C_3-C_6 环烷基, 任选地被最高达一个环丙基和最高达2个选自卤素、-CN、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 卤代烷基的取代基取代。

[0261] 实施例34d. 如实施例34所述的化合物, 其中, R^{14} 是 C_4-C_7 环烷基烷基, 任选地被最高达一个环丙基和最高达2个选自卤素、-CN、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 卤代烷基的取代基取代。

[0262] 实施例35. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, R^{14} 是 $(CH_2)_p Q^4$ 。

[0263] 实施例36. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, R^{14} 是 OR^{16} 。

[0264] 实施例36a. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, R^{14} 是 $NR^{17a}R^{17b}$ 。

[0265] 实施例37. 如前述实施例中任一项所述的式1的化合物, 其中, Q^4 是3元至6元饱和

杂环,其含有选自碳原子和一个独立地选自一个氧和一个硫的杂原子的环成员,其中该硫原子环成员选自S、S(=O)或S(=O)₂,每个环任选地被最高达2个独立地选自R¹⁸的取代基取代。

[0266] 实施例37a.如实施例37所述的化合物,其中,Q⁴是3元至6元饱和杂环,其含有选自碳原子和一个独立地选自一个氧和一个硫的杂原子的环成员,任选地被最高达2个独立地选自R¹⁸的取代基取代。

[0267] 实施例38.如前述实施例中任一项所述的式1的化合物,其中,R¹⁶是C₁-C₄烷基或C₁-C₄卤代烷基。

[0268] 实施例38a.如实施例38所述的化合物,其中R¹⁶是C₁-C₂烷基或C₁-C₂卤代烷基。

[0269] 实施例39.如前述实施例中任一项所述的式1的化合物,其中,R^{17a}是C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基或C₃-C₆环烷基。

[0270] 实施例39a.如实施例39所述的化合物,其中,R^{17a}是H、C₁-C₂烷基、C₁-C₂卤代烷基或C₃-C₅环烷基。

[0271] 实施例39b.如实施例39所述的化合物,其中R^{17a}是C₁-C₂烷基或C₁-C₂卤代烷基。

[0272] 实施例39c.如实施例39所述的化合物,其中R^{17a}是C₁-C₂烷基。

[0273] 实施例39d.如实施例39所述的化合物,其中R^{17a}是C₁-C₂卤代烷基。

[0274] 实施例40.如前述实施例中任一项所述的式1的化合物,其中,R^{17b}是H、C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基或C₃-C₆环烷基。

[0275] 实施例40a.如实施例40所述的化合物,其中R^{17b}是H、C₁-C₂烷基、C₁-C₂卤代烷基或C₃-C₅环烷基。

[0276] 实施例40b.如实施例40所述的化合物,其中R^{17b}是H、C₁-C₂烷基或C₁-C₂卤代烷基。

[0277] 实施例40c.如实施例40所述的化合物,其中R^{17b}是H或C₁-C₄烷基。

[0278] 实施例40d.如实施例40所述的化合物,其中R^{17a}和R^{17b}是H。

[0279] 实施例41.如前述实施例中任一项所述的式1的化合物,其中,R^{17a}和R^{17b}连同它们所附接的氮一起形成3元至6元环,该环含有选自碳原子和最高达一个独立地选自氮、硫和氧的另外原子的环成员,其中该硫原子环成员选自S、S(=O)和S(=O)₂,所述环任选地被1至4个独立地选自以下各项的取代基取代:卤素、C₁-C₂烷基、C₁-C₂卤代烷基、C₁-C₂烷氧基、C₁-C₂卤代烷氧基、-CN和-NO₂。

[0280] 实施例41a.如实施例41所述的化合物,其中,R^{17a}和R^{17b}连同它们所附接的氮一起形成3元至6元环,该环含有选自碳原子和最高达一个独立地选自氮、硫和氧的另外原子的环成员,所述环任选地被1至2个独立地选自以下各项的取代基取代:卤素、C₁-C₂烷基、C₁-C₂卤代烷基、C₁-C₂烷氧基、C₁-C₂卤代烷氧基、-CN和-NO₂。

[0281] 实施例41b.如实施例41所述的化合物,其中,R^{17a}和R^{17b}连同它们所附接的氮一起形成3元至6元环,该环含有选自碳原子和最高达一个独立地选自氮、硫和氧的另外原子的环成员,所述环任选地被1至2个独立地选自以下各项的取代基取代:卤素、C₁-C₂烷基和C₁-C₂卤代烷基。

[0282] 实施例41c.如实施例41所述的化合物,其中,R^{17a}和R^{17b}连同它们所附接的氮一起形成3元至5元环,该环含有选自碳原子和最高达一个独立地选自氮、硫和氧的另外原子的环成员,所述环任选地被1至2个独立地选自以下各项的取代基取代:卤素、C₁-C₂烷基和C₁-

C₂卤代烷基。

[0283] 实施例42.如前述实施例中任一项所述的式1的化合物,其中,每个R¹⁸独立地是卤素、-CN、C₁-C₂烷基或C₁-C₂卤代烷基。

[0284] 实施例43.如前述实施例中任一项所述的式1的化合物,其中,R¹⁹是H、C₁-C₄烷基或C₁-C₄卤代烷基。

[0285] 实施例44.如前述实施例中任一项所述的式1的化合物,其中,R²⁰是C₁-C₄烷基或C₁-C₄卤代烷基。

[0286] 实施例45.如前述实施例中任一项所述的式1的化合物,其中,R²¹是H或C₁-C₄烷基。

[0287] 实施例46.如前述实施例中任一项所述的式1的化合物,其中,R²²是C₁-C₄烷基、C₁-C₄卤代烷基、C₁-C₄烷氧基或C₃-C₆环烷基。

[0288] 实施例47.如前述实施例中任一项所述的式1的化合物,其中,n是0、1或2。

[0289] 实施例47a.如实施例47所述的化合物,其中n是0。

[0290] 实施例47b.如实施例47所述的化合物,其中n是1或2。

[0291] 实施例47c.如实施例47所述的化合物,其中n是1。

[0292] 实施例47d.如实施例47所述的化合物,其中n是2。

[0293] 实施例48.如前述实施例中任一项所述的式1的化合物,其中,p是0或1。

[0294] 实施例48a.如实施例48所述的化合物,其中p是0。

[0295] 实施例48b.如实施例48所述的化合物,其中p是1。

[0296] 实施例S1.如实施例1-48b中任一项所述的化合物,其中,该式1的化合物是式1'的化合物。

[0297] 实施例S2.如实施例1-48b中任一项所述的化合物,其中,该式1的化合物是式1''的化合物。

[0298] 实施例S3.一种由式1'的化合物和式1''的化合物组成的组合物,其中该式1'的化合物与该式1''的化合物的比率大于60:40。

[0299] 实施例S3a.如实施例S3所述的组合物,其中该式1'的化合物与该式1''的化合物的比率大于80:20。

[0300] 实施例S3b.如实施例S3所述的组合物,其中该式1'的化合物与该式1''的化合物的比率大于90:10。

[0301] 实施例S3c.如实施例S3所述的组合物,其中该式1'的化合物与该式1''的化合物的比率大于99:1。

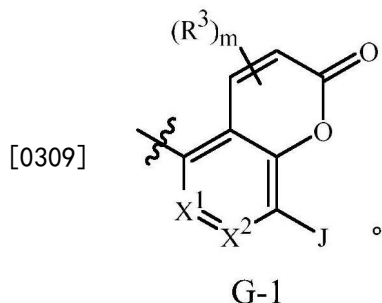
[0302] 实施例S4.一种由式1''的化合物和式1'的化合物组成的组合物,其中该式1''的化合物与该式1'的化合物的比率大于60:40。

[0303] 实施例X.一种用于防治无脊椎有害生物的方法,该方法包括使该无脊椎有害生物或其环境与生物学有效量的式1的化合物接触。

[0304] 实施例X1.如权利要求X所述的方法,其中,所述环境是土壤或植物叶子。

[0305] 本披露的实施例(包括上述实施例1-X1以及本文所述的任何其他实施例)可以以任何方式组合,并且实施例中的变量的描述不仅涉及式1的化合物,而且还涉及可用于制备式1的化合物的起始化合物和中间体化合物。另外,本披露的实施例(包括上述实施例1-X1以及本文所述的任何其他实施例)及其任何组合涉及本披露的组合物和方法。

- [0306] 实施例1-X1的组合如下所示：
 [0307] 实施例A. 一种式1的化合物，其中，
 [0308] G是



- [0310] 实施例AA. 如实施例A所述的式1的化合物，其中，
 [0311] A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 和 A^5 各自独立地是 CR^2 ；
 [0312] X是O或 CH_2 ；
 [0313] X^1 和 X^2 各自独立地是 CR^3 ；
 [0314] 每个 R^2 独立地是H、卤素、-CN、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基；
 [0315] 每个 R^3 独立地是H、卤素、-CN、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基和 C_1 - C_4 卤代烷氧基；或者
 [0316] J是 $C(=Z)NR^4R^5$ 。
 [0317] 实施例AA1. 如实施例AA所述的化合物，其中
 [0318] A^4 是CH；
 [0319] A^5 是CH；
 [0320] X是O；
 [0321] 每个 R^2 独立地是H、卤素、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 卤代烷氧基；
 [0322] 每个 R^3 独立地是H、卤素、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 卤代烷氧基；
 [0323] Z是O；
 [0324] R^4 是H、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_7 烷基羰基或 C_2 - C_7 烷氧基羰基；
 [0325] R^5 是H、 $CHR^{12}NHR^{11}$ ；或 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_7 烷基环烷基或 C_4 - C_7 环烷基烷基，各自任选地被一个或多个独立地选自 R^7 的取代基取代；
 [0326] 每个 R^7 独立地是卤素、 C_1 - C_4 烷基或 C_1 - C_4 烷氧基；
 [0327] R^{11} 是H、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_7 烷基羰基、 C_2 - C_7 卤代烷基羰基或 C_2 - C_7 烷氧基羰基；
 [0328] R^{12} 是H；或 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_7 烷基环烷基或 C_4 - C_7 环烷基烷基，各自任选地被一个或多个独立地选自 R^7 的取代基取代。
 [0329] 实施例AA2. 如实施例AA1所述的化合物，其中，
 [0330] 每个 R^2 独立地是H、卤素、 C_1 - C_2 卤代烷基或 C_1 - C_2 卤代烷氧基；
 [0331] 每个 R^3 是H；
 [0332] R^4 是H；

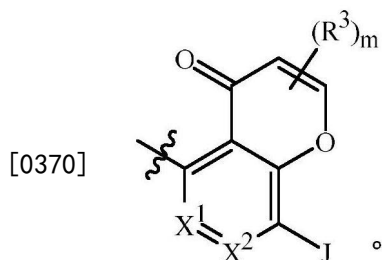
- [0333] R^5 是 $CHR^{12}NHR^{11}$;或 C_1-C_4 烷基、 C_3-C_6 环烷基、或 C_4-C_7 环烷基烷基,各自任选地被一个或多个独立地选自 R^7 的取代基取代;
- [0334] R^{11} 是H;并且
- [0335] R^{12} 是 C_1-C_4 烷基。
- [0336] 实施例AA3.如实施例AA2所述的化合物,其中,
- [0337] R^5 是环丙基、环丙基甲基或 $-CH(CH_3)C(=O)NH_2$ 。
- [0338] 实施例AB.如实施例A所述的式1的化合物,其中,
- [0339] A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 和 A^5 各自独立地是 CR^2 ;
- [0340] X是O或 CH_2 ;
- [0341] X^1 和 X^2 各自独立地是 CR^3 ;
- [0342] 每个 R^2 独立地是H、卤素、 $-CN$ 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 卤代烷氧基;
- [0343] 每个 R^3 独立地是H、卤素、 $-CN$ 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 卤代烷氧基;并且
- [0344] J是 $CH(R^6)N(R^{13})C(=Z)R^{14}$ 。
- [0345] 实施例AB1.如实施例AB所述的化合物,其中,
- [0346] A^4 是CH;
- [0347] A^5 是CH;
- [0348] X是O;
- [0349] 每个 R^2 独立地是H、卤素、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 卤代烷基、 C_1-C_2 烷氧基或 C_1-C_2 卤代烷氧基;
- [0350] 每个 R^3 独立地是H、卤素、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 卤代烷基、 C_1-C_2 烷氧基或 C_1-C_2 卤代烷氧基;
- [0351] Z是O;
- [0352] R^6 是H、 C_1-C_3 烷基或 C_1-C_3 卤代烷基;并且
- [0353] R^{13} 是H、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_7 烷基羰基或 C_2-C_7 烷氧基羰基。
- [0354] 实施例AB2.如实施例AB1所述的化合物,其中,
- [0355] 每个 R^2 独立地是H、卤素、 C_1-C_2 卤代烷基或 C_1-C_2 卤代烷氧基;
- [0356] 每个 R^3 是H;
- [0357] R^6 是H;
- [0358] R^{13} 是H;
- [0359] R^{14} 是任选地被卤素取代的 C_1-C_6 烷基;或者
- [0360] R^{14} 是 C_3-C_6 环烷基或 C_4-C_7 环烷基烷基,各自任选地被最高达一个环丙基和最高达2个选自卤素、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 卤代烷基的取代基取代;或者
- [0361] R^{14} 是 $NR^{17a}R^{17b}$;
- [0362] R^{17a} 是 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 卤代烷基;并且
- [0363] R^{17b} 是H。
- [0364] 实施例AB3.如实施例AB2所述的化合物,其中,
- [0365] R^{14} 是任选地被卤素取代的 C_1-C_4 烷基。

[0366] 实施例AB4. 如实施例AB3所述的化合物, 其中,

[0367] R^{14} 是甲基或乙基。

[0368] 实施例B. 一种式1的化合物, 其中,

[0369] G是



G-2

[0371] 实施例BA. 如实施例B所述的式1的化合物, 其中,

[0372] A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 和 A^5 各自独立地是 CR^2 ;

[0373] X是O或 CH_2 ;

[0374] X^1 和 X^2 各自独立地是 CR^3 ;

[0375] 每个 R^2 独立地是H、卤素、-CN、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基;

[0376] 每个 R^3 独立地是H、卤素、-CN、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基; 并且

[0377] J是 $C(=Z)NR^4R^5$ 。

[0378] 实施例BA1. 如实施例BA所述的化合物, 其中,

[0379] A^4 是CH;

[0380] A^5 是CH;

[0381] X是O;

[0382] 每个 R^2 独立地是H、卤素、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 卤代烷氧基;

[0383] 每个 R^3 独立地是H、卤素、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 卤代烷氧基;

[0384] Z是O;

[0385] R^4 是H、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_7 烷基羰基或 C_2 - C_7 烷氧基羰基;

[0386] R^5 是 $CHR^{12}NHR^{11}$; 或 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_7 烷基环烷基或 C_4 - C_7 环烷基烷基, 各自任选地被一个或多个独立地选自 R^7 的取代基取代;

[0387] 每个 R^7 独立地是卤素、 C_1 - C_4 烷基或 C_1 - C_4 烷氧基;

[0388] R^{11} 是H、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_7 烷基羰基、 C_2 - C_7 卤代烷基羰基或 C_2 - C_7 烷氧基羰基;

[0389] R^{12} 是H; 或 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_4 - C_7 烷基环烷基或 C_4 - C_7 环烷基烷基, 各自任选地被一个或多个独立地选自 R^7 的取代基取代。

[0390] 实施例BA2. 如实施例BA1所述的化合物, 其中,

[0391] 每个 R^2 独立地是H、卤素、 C_1 - C_2 卤代烷基或 C_1 - C_2 卤代烷氧基;

[0392] 每个 R^3 是H;

- [0393] R^4 是H;
- [0394] R^5 是 $\text{CHR}^{12}\text{NHR}^{11}$;或 C_1 - C_4 烷基、 C_3 - C_6 环烷基、或 C_4 - C_7 环烷基烷基,各自任选地被一个或多个独立地选自 R^7 的取代基取代;
- [0395] R^{11} 是H;并且
- [0396] R^{12} 是 C_1 - C_4 烷基。
- [0397] 实施例BA3.如实施例BA2所述的化合物,其中,
- [0398] R^5 是环丙基、环丙基甲基或 $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ 。
- [0399] 实施例BB.如实施例B所述的式1的化合物,其中,
- [0400] A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 和 A^5 各自独立地是 CR^2 ;
- [0401] X是O或 CH_2 ;
- [0402] X^1 和 X^2 各自独立地是 CR^3 ;
- [0403] 每个 R^2 独立地是H、卤素、 $-\text{CN}$ 、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基;
- [0404] 每个 R^3 独立地是H、卤素、 $-\text{CN}$ 、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基;并且
- [0405] J是 $\text{CH}(\text{R}^6)\text{N}(\text{R}^{13})\text{C}(=\text{Z})\text{R}^{14}$ 。
- [0406] 实施例BB1.如实施例BB所述的化合物,其中,
- [0407] A^4 是CH;
- [0408] A^5 是CH;
- [0409] X是O;
- [0410] 每个 R^2 独立地是H、卤素、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 卤代烷氧基;
- [0411] 每个 R^3 独立地是H、卤素、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 卤代烷氧基;
- [0412] Z是O;
- [0413] R^6 是H、 C_1 - C_3 烷基或 C_1 - C_3 卤代烷基;并且
- [0414] R^{13} 是H、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_7 烷基羰基或 C_2 - C_7 烷氧基羰基。
- [0415] 实施例BB2.如实施例BB1所述的化合物,其中,
- [0416] 每个 R^2 独立地是H、卤素、 C_1 - C_2 卤代烷基或 C_1 - C_2 卤代烷氧基;
- [0417] 每个 R^3 是H;
- [0418] R^6 是H;
- [0419] R^{13} 是H;
- [0420] R^{14} 是任选地被卤素取代的 C_1 - C_6 烷基;或者
- [0421] R^{14} 是 C_3 - C_6 环烷基或 C_4 - C_7 环烷基烷基,各自任选地被最高达一个环丙基和最高达2个选自卤素、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 卤代烷基的取代基取代;或者
- [0422] R^{14} 是 $\text{NR}^{17a}\text{R}^{17b}$;
- [0423] R^{17a} 是 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 卤代烷基;并且
- [0424] R^{17b} 是H。
- [0425] 实施例BB3.如实施例BB2所述的化合物,其中,

- [0426] R¹⁴是任选地被卤素取代的C₁-C₄烷基。
- [0427] 实施例BB4.如实施例BB3所述的化合物,其中,
- [0428] R¹⁴是甲基或乙基。
- [0429] 实施例C.如实施例A-BB3中任一项所述的化合物,其中该式1的化合物是式1'。
- [0430] 实施例D.如实施例A-BB3中任一项所述的化合物,其中该式1的化合物是式1''。
- [0431] 具体实施例包括选自由以下组成的组的式1的化合物:
- [0432] N-环丙基-5-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,
- [0433] N-环丙基-5-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,
- [0434] (R)-N-环丙基-5-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,
- [0435] (S)-N-环丙基-5-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,
- [0436] N-环丙基-5-[4,5-二氢-5-(三氟甲基)-5-[3-(三氟甲基)苯基]-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,
- [0437] N-(环丙基甲基)-5-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,
- [0438] N-(环丙基甲基)-5-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,
- [0439] N-(环丙基甲基)-5-[4,5-二氢-5-(三氟甲基)-5-[3-(三氟甲基)苯基]-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,
- [0440] N-(2-氨基-1-甲基-2-氧代乙基)-5-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,
- [0441] N-(2-氨基-1-甲基-2-氧代乙基)-5-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,
- [0442] N-(2-氨基-1-甲基-2-氧代乙基)-5-[4,5-二氢-5-(三氟甲基)-5-[3-(三氟甲基)苯基]-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-甲酰胺,
- [0443] N-[[5-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-基]甲基]乙酰胺,
- [0444] N-[[5-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-基]甲基]乙酰胺,以及
- [0445] N-[[5-[4,5-二氢-5-(三氟甲基)-5-[3-(三氟甲基)苯基]-3-异噁唑基]-2-氧代-2H-1-苯并吡喃-8-基]甲基]乙酰胺。
- [0446] 实施例Y1.一种组合物,该组合物包含如式1或前述实施例中任一项所述的化合物以及至少一种选自由表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂组成的组的附加组分,所述组合物任选地进一步包含至少一种附加生物学活性化合物或药剂。
- [0447] 实施例Y2.如实施例Y1所述的组合物,其中该至少一种附加生物学活性化合物或剂选自下组,该组由以下各项组成:阿巴汀(abamectin)、乙酰甲胺磷(acephate)、灭螨醌

(acequinocyl)、啉虫脒(acetamiprid)、氟丙菊酯(acrinathrin)、双丙环虫酯(afidopyropen)、磺胺螯酯(amidoflumet)、双甲脒(amitraz)、阿维菌素(ivermectin)、印楝素(azadirachtin)、保棉磷(azinphos-methyl)、丙硫克百威(benfuracarb)、杀虫磺(bensultap)、联苯菊酯(bifenthrin)、联苯胂酯(bifenazate)、双三氟虫脒(bistrifluron)、硼酸盐(borate)、溴虫苯甲酰胺(bromantraniliprole)、噻嗪酮(buprofezin)、甲萘威(carbaryl)、克百威(carbofuran)、杀螟丹(cartap)、伐虫脒(carzol)、氯虫苯甲酰胺(chlorantraniliprole)、溴虫腈(chlorfenapyr)、氟啉脒(chlorfluazuron)、毒死蜱(chlorpyrifos)、甲基毒死蜱(chlorpyrifos-methyl)、环虫酰肼(chromafenozide)、四螨嗪(clofentezin)、噻虫胺(clothianidin)、溴氰虫酰胺(cyantraniliprole)、环溴虫酰胺(cyclaniliprole)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、环氧虫啉(cycloxaprid)、丁氟螯酯(cyflumetofen)、氟氯氰菊酯(cyfluthrin)、高效氟氯氰菊酯(beta-cyfluthrin)、氯氟氰虫酰胺(cyhalodiamide)、三氟氯氰菊酯(cyhalothrin)、精高效氯氟氰菊酯(gamma-cyhalothrin)、高效氯氟氰菊酯(lambda-cyhalothrin)、氯氰菊酯(cypermethrin)、顺式氯氰菊酯(alpha-cypermethrin)、 ζ -氯氰菊酯(zeta-cypermethrin)、灭蝇胺(cyromazine)、溴氰菊酯(deltamethrin)、丁醚脒(diafenthiuron)、二嗪磷(diazinon)、双氯虫苯甲酰胺(dichlorantraniliprole)、狄氏剂(dieldrin)、除虫脒(diflubenzuron)、四氟甲醚菊酯(dimefluthrin)、杀虫双(dimehypo)、乐果(dimethoate)、呋虫胺(dinotefuran)、苯虫醚(diufenolan)、甲氨基阿维菌素(emamectin)、硫丹(endosulfan)、高氰戊菊酯(esfenvalerate)、乙虫腈(ethiprole)、醚菊酯(etofenprox)、乙螨唑(etoxazole)、苯丁锡(fenbutatinoxide)、杀螟硫磷(fenitrothion)、苯硫威(fenothiocarb)、苯氧威(fenoxycarb)、甲氰菊酯(fenpropathrin)、氰戊菊酯(fenvalerate)、氟虫腈(fipronil)、氟麦托醌(flometoquin)、氟啉虫酰胺(flonicamid)、氟虫双酰胺(flubendiamide)、氟氰戊菊酯(flucythrinate)、噁虫胺(flufenexim)、氟虫脒(flufenoxuron)、氟菌螯酯(flufenoxystrobin)、联氟砜(fluensulfone)、氟吡菌酰胺(fluopyram)、氟吡呋喃酮(flupyradifurone)、氟胺氰菊酯(fluvalinate)、氟胺氰戊菊酯(tau-fluvalinate)、地虫硫磷(fonophos)、伐虫脒(formetanate)、噻唑膦(fosthiazate)、氯虫酰肼(halofenozide)、七氟甲醚菊酯(heptafluthrin)、氟铃脒(hexaflumuron)、噻螨酮(hexythiazox)、氟蚁腠(hydramethylnon)、吡虫啉(imidacloprid)、茚虫威(indoxacarb)、杀虫肥皂、异丙胺磷(isofenphos)、虱螨脒(lufenuron)、马拉硫磷(malathion)、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、氰氟虫腠(metaflumizone)、四聚乙醛(metaldehyde)、甲胺磷(methamidophos)、杀扑磷(methidathion)、甲硫威(methiocarb)、灭多威(methomyl)、烯虫酯(methoprene)、甲氧滴滴涕(methoxychlor)、甲氧虫酰肼(methoxyfenozide)、甲氧苄氟菊酯(metofluthrin)、久效磷(monocrotophos)、单氟菊酯(monofluorothrin)、烟碱(nicotine)、N-[1,1-二甲基-2-(甲硫基)乙基]-7-氟-2-(3-吡啶基)-2H-吡唑-4-甲酰胺、N-[1,1-二甲基-2-(甲基亚磺酰基)乙基]-7-氟-2-(3-吡啶基)-2H-吡唑-4-甲酰胺、N-[1,1-二甲基-2-(甲基磺酰基)乙基]-7-氟-2-(3-吡啶基)-2H-吡唑-4-甲酰胺、N-(1-甲基环丙基)-2-(3-吡啶基)-2H-吡唑-4-甲酰胺、N-[1-(二氟甲基)环丙基]-2-(3-吡啶基)-2H-吡唑-4-甲酰胺、烯啶虫胺(nitenpyram)、硝虫噻嗪(nithiazine)、氟酰脒(novaluron)、多氟脒(noviflumuron)、杀线

威(oxamyl)、对硫磷(parathion)、甲基对硫磷(parathion-methyl)、氯菊酯(permethrin)、甲拌磷(phorate)、伏杀硫磷(phosalone)、亚胺硫磷(phosmet)、磷胺(phosphamidon)、抗蚜威(pirimicarb)、丙溴磷(profenofos)、丙氟菊酯(profluthrin)、炔螨特(propargite)、丙苯炔菊酯(protrifenbute)、吡氟丁酰胺(pyflubumide)、吡蚜酮(pymetrozine)、啉吡啉虫胺(pyrafluprole)、除虫菊素(pyrethrin)、吡蚜灵(pyridaben)、啉虫丙醚(pyridalyl)、吡氟啉虫啉(pyrifluquinazon)、啉啉胺(pyriminostrobin)、吡啉虫啉(pyriprole)、吡丙醚(pyriproxyfen)、鱼藤酮(rotenone)、兰尼碱(ryanodine)、氟硅菊酯(silafluofen)、乙基多杀菌素(spinetoram)、多杀菌素(spinosad)、螺螨酯(spirodiclofen)、螺甲螨酯(spiromesifen)、螺虫乙酯(spirotetramat)、硫丙磷(sulprofos)、氟啉虫胺腈(sulfoxafloz)、虫酰肼(tebufenozide)、吡蚜胺(tebufenpyrad)、氟苯脲(teflubenzuron)、七氟菊酯(tefluthrin)、四氯虫酰胺(tetrachlorantraniliprole)、杀虫畏(tetrachlorvinphos)、胺菊酯(tetramethrin)、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)、噻虫啉(thiacloprid)、噻虫嗪(thiamethoxam)、硫双威(thiodicarb)、杀虫双(thiosultap-sodium)、噻啉沙芬(tioxazafen)、啉虫酰胺(tolfenpyrad)、四溴菊酯(tralomethrin)、啉蚜威(triazamate)、敌百虫(trichlorfon)、三氟苯啉啉(triflumezopyrim)、杀铃脲(triflumuron)、苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*) δ -内毒素、昆虫病原细菌、昆虫病原病毒和昆虫病原真菌。

[0448] 实施例Y3.如实施例Y2所述的组合物,其中该至少一种附加生物学活性化合物或剂选自下组,该组由以下各项组成:阿巴汀、啉虫脒、氟丙菊酯、双丙环虫酯、双甲脒、阿维菌素、印楝素、丙硫克百威、杀虫磺、联苯菊酯、噻嗪酮、甲萘威、杀螟丹、氯虫苯甲酰胺、溴虫腈、毒死蜱、噻虫胺、溴氰虫酰胺、环溴虫酰胺、乙氰菊酯、氟氯氰菊酯、高效氟氯氰菊、三氟氯氰菊酯、精高效氯氟氰菊酯、高效氯氟氰菊酯、氯氰菊酯、顺式氯氰菊酯、 ζ -氯氰菊酯、灭蝇胺、溴氰菊酯、狄氏剂、呋虫胺、苯虫醚、甲氨基阿维菌素、硫丹、高氰戊菊酯、乙虫腈、醚菊酯、乙螨啉、杀螟硫磷、苯硫威、苯氧威、氰戊菊酯、氟虫腈、氟麦托醌、氟啉虫酰胺、氟虫双酰胺、氟虫脲、氟菌螨酯、联氟砜、flupiprole、氟吡呋喃酮、氟胺氰菊酯、伐虫脒、噻啉膦、七氟甲醚菊酯、氟铃脲、氟蚁腠、吡虫啉、茚虫威、虱螨脲、氯氟醚菊酯、氰氟虫腠、甲硫威、灭多威、烯虫酯、甲氧虫酰肼、甲氧苄氟菊酯、单氟菊酯、烯啉虫胺、硝虫噻嗪、氟酰脲、杀线威、吡氟丁酰胺、吡蚜酮、除虫菊素、吡蚜灵、啉虫丙醚、啉啉胺、吡丙醚、兰尼碱、乙基多杀菌素、多杀菌素、螺螨酯、螺甲螨酯、螺虫乙酯、氟啉虫胺腈、虫酰肼、胺菊酯、四氟醚菊酯、噻虫啉、噻虫嗪、硫双威、杀虫双、四溴菊酯、啉蚜威、三氟苯啉啉、杀铃脲、苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素、苏云金芽孢杆菌的所有菌株和核型多角体病毒(nuclear polyhedrosis viruses)的所有毒株。

[0449] 实施例Y4.如实施例Y1-Y3中任一项所述的组合物,该组合物进一步包含液体肥料。

[0450] 实施例Y5.如实施例Y4所述的组合物,其中液体肥料是水基的。

[0451] 实施例Y6.一种土壤浸液制剂,该土壤浸液制剂包含如实施例Y1-Y3中任一项所述的组合物。

[0452] 实施例Y7.一种喷雾组合物,该喷雾组合物包含如实施例Y1-Y3中任一项所述的组合物以及推进剂。

[0453] 实施例Y8.一种诱饵组合物,该诱饵组合物包含如实施例Y1-Y3中任一项所述的组合物、一种或多种食物材料、任选的引诱剂和任选的湿润剂。

[0454] 实施例Y9.一种用于防治无脊椎有害生物的诱捕装置,所述诱捕装置包含:如实施例Y8所述的诱饵组合物和被适配成容纳所述诱饵组合物的外壳,其中外壳具有至少一个开口,该开口的大小被设定成允许无脊椎有害生物通过开口,使无脊椎有害生物能够从外壳外部的的位置接近所述诱饵组合物,并且其中外壳进一步被适配成放置在无脊椎有害生物可能或已知的活动所在地中或附近。

[0455] 实施例Y10.一种包含如实施例Y1-Y3中任一项所述的组合物的组合物,其中该组合物是选自粉剂、粉末、颗粒剂、球剂、粒剂、锭剂、片剂和填充膜的固体组合物。

[0456] 实施例Y11.如实施例Y10所述的组合物,其中该组合物是水可分散的或水溶性的。

[0457] 实施例Y12.一种包含如实施例Y1-Y3中任一项所述的组合物的液体或干制剂,该液体或干制剂用于滴灌系统、种植期间的垄沟、手持式喷雾器、背负式喷雾器、喷杆式喷雾器、地面喷雾器、空气施加、无人飞行载具或种子处理。

[0458] 实施例Y13.如实施例Y12所述的液体或干制剂,其中所述制剂以超低体积喷雾。

[0459] 值得注意的是,本披露的化合物的特征在于有利的代谢模式和/或土壤残留模式,并且表现出防治广谱农学和非农学无脊椎有害生物的活性。

[0460] 特别值得注意的是,由于无脊椎有害生物防治谱和经济学重要性的原因,通过防治无脊椎有害生物来保护农业作物免受无脊椎有害生物引起的损害或伤害是本披露的实施例。本披露的化合物由于其在植株中的有利转移特性或内吸性(systemicity)还保护叶或不与式1的化合物或包含该化合物的组合物直接接触的其他植株部分。

[0461] 还值得注意的作为本披露的实施例的是包含如前述实施例中任一项以及本文所述的任何其他实施例及其任何组合所述的化合物,以及至少一种选自由表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂组成的组的附加组分的组合物,所述组合物任选地进一步包含至少一种附加生物学活性化合物或药剂。

[0462] 另外值得注意的作为本披露的实施例的是用于防治无脊椎有害生物的包含如前述实施例中任一项以及本文所述的任何其他实施例及其任何组合所述的化合物,以及至少一种选自由表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂组成的组的附加组分的组合物,所述组合物任选地进一步包含至少一种附加生物学活性化合物或药剂。本披露的实施例进一步包括用于防治无脊椎有害生物的方法,这些方法包括使无脊椎有害生物或其环境与生物学有效量的如前述实施例中任一项所述的化合物(例如,作为本文所述的组合物)接触。

[0463] 本披露的实施例还包括包含任何前述实施例的化合物的土壤浸液液体制剂形式的组合物。本披露的实施例进一步包括用于防治无脊椎有害生物的方法,这些方法包括使土壤与包含生物学有效量的任何前述实施例的化合物的作为土壤浸液的液体组合物接触。

[0464] 本披露的实施例还包括用于防治无脊椎有害生物的喷雾组合物,该喷雾组合物包含生物学有效量的如前述实施例中任一项所述的化合物以及推进剂。本披露的实施例进一步包括用于防治无脊椎有害生物的诱饵组合物,该诱饵组合物包含生物学有效量的如前述实施例中任一项所述的化合物、一种或多种食物材料、任选的引诱剂和任选的湿润剂。本披露的实施例还包括一种用于防治无脊椎有害生物的装置,该装置包含所述诱饵组合物和被适配成容纳所述诱饵组合物的外壳,其中外壳具有至少一个开口,其大小设定成允许无脊

椎有害生物通过开口,使无脊椎有害生物能够从外壳以外的位置接近所述诱饵组合物,并且其中外壳进一步被适配成放置于无脊椎有害生物可能或已知的活动场所中或附近。

[0465] 本披露的实施例还包括用于保护种子免受无脊椎有害生物侵害的方法,这些方法包括使种子与生物学有效量的如前述实施例中任一项所述的化合物接触。

[0466] 本披露的实施例还包括用于保护动物免受无脊椎寄生性有害生物侵害的方法,这些方法包括向动物施用杀寄生虫有效量的如前述实施例中任一项所述的化合物。

[0467] 本披露的实施例还包括用于防治无脊椎有害生物的方法,这些方法包括使无脊椎有害生物或其环境与生物学有效量的式1的化合物、其N-氧化物或盐(例如,作为本文所述的组合物)接触,前提是这些方法不是通过治疗对人体或动物体进行医学治疗的方法。

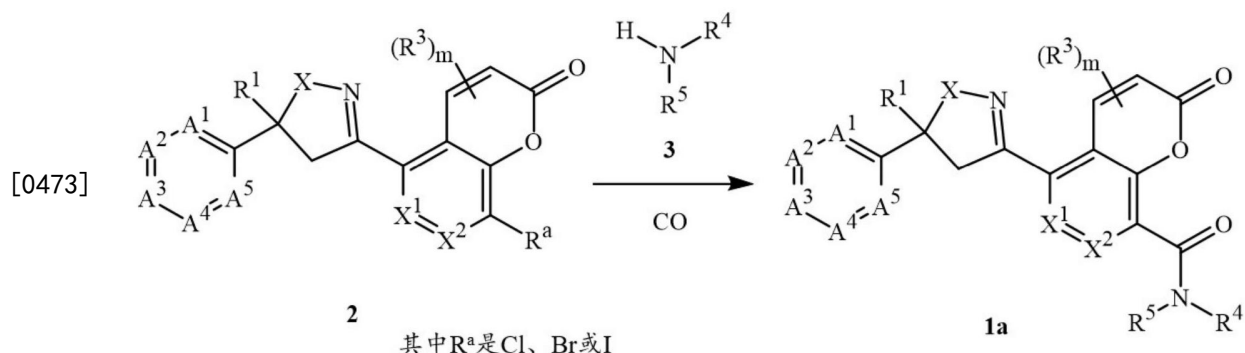
[0468] 本披露还涉及这样的方法,其中无脊椎有害生物或其环境与包含生物学有效量的式1的化合物、其N-氧化物或盐以及至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂组成的组的附加组分的组合物接触,所述组合物任选地进一步包含生物学有效量的至少一种附加生物学活性化合物或药剂,前提是这些方法不是通过治疗对人体或动物体进行医学治疗的方法。

[0469] 本披露的实施例还包括使用无人飞行载具(UAV)将本文所披露的组合物分散在种植区域。在一些实施例中,种植区域是含有作物的区域。在一些实施例中,作物选自单子叶(monocot)或双子叶(dicot)。在一些实施例中,作物选自稻、玉米、大麦、大豆、小麦、蔬菜、烟草、茶树、果树和甘蔗。在一些实施例中,本文所披露的组合物被配制用于以超低容量喷雾。通过无人机施用的产品可使用水或油作为喷雾载体。全球用于无人机施用的典型喷雾体积(包括产品)为5.0升/公顷-100升/公顷(约0.5-10gpa)。这包括超低喷雾容量(ULV)至低喷雾容量(LV)的范围。虽然不常见,但可能存在这样的情况,其中可使用低至1.0升/公顷(0.1gpa)的甚至更低的喷雾容量。

[0470] 式1的化合物可以通过如下列方案1-21中描述的一种或多种方法和变体来制备。除非另有说明,否则下文式1-36的化合物中的取代基的定义如上文发明内容中所定义。式1a、1b、1c和1d的化合物是式1的化合物的子集;式2a是式2的子集;式9a是式9的子集;式13a是式13的子集;式20a是式20的子集;以及式27a是式27的子集。除非另有说明,否则每个子集式的取代基如其母体式所定义。环境温度或室温定义为约20°C-25°C。

[0471] 式1a的化合物(即,其中G是G-1,J是C(=Z)NR⁴R⁵并且Z是O的式1)可以通过用使式2的芳基卤化物(其中R^a是Cl、Br或I)与式3的胺进行氨基羰基化来制备,如方案1中所示。

[0472] 方案1



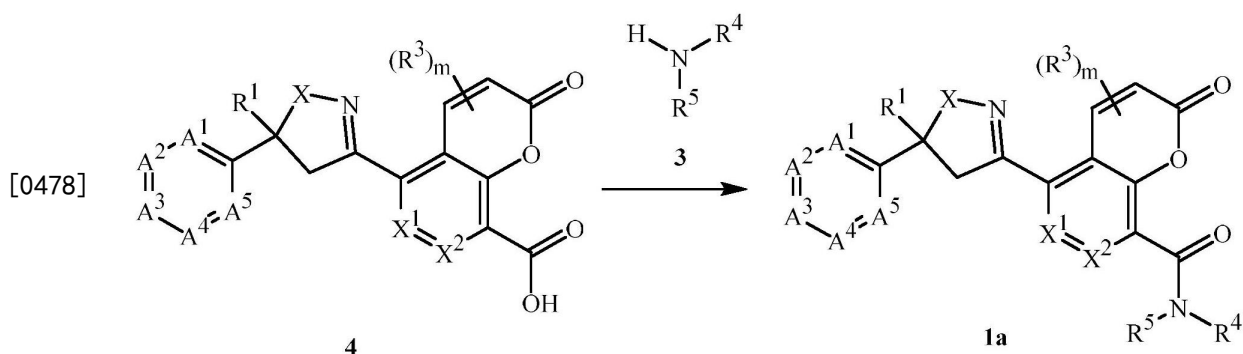
[0474] 该反应典型地用式2的芳基溴化物(其中X是Br)在钯催化剂的存在下在CO气氛下

进行。用于本发明方法的钯催化剂典型地包含以形式氧化态为0(即Pd(0))或2(即Pd(II))的钯。多种此类含钯化合物和络合物可用作本发明方法的催化剂。在方案1的方法中可用作催化剂的含钯化合物和络合物的实例包括PdCl₂(PPh₃)₂(即,双(三苯基膦)二氯化钯(II))、Pd₂(dba)₃(即,三(二亚苄基丙酮)二钯(0))、Pd(PPh₃)₄(即,四(三苯基膦)钯(0))、Pd(C₅H₇O₂)₂(即,乙酰丙酮钯(II))和二氯-[1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁]钯(II)。方案1的方法通常在液相中进行,并且因此为了最有效,钯催化剂优选在液相中具有良好的溶解度。有用的溶剂包括例如醚诸如1,2-二甲氧基乙烷、酰胺诸如N,N-二甲基乙酰胺和非卤化芳族烃诸如甲苯。

[0475] 方案1的方法可以在广泛范围的温度(范围为从约25°C至约150°C)内进行。值得注意的是从约60°C至约110°C的温度,这典型地提供了更快的反应速率和更高的产物产率。用于用芳基溴化物和胺进行氨基羰基化的一般方法和程序在文献中是熟知的;参见,例如,H.Horino等人,Synthesis[合成]1989,715;和J.J.Li,G.W.Gribble,编辑,Palladium in Heterocyclic Chemistry:A Guide for the Synthetic Chemist[杂环化学中的钯:合成化学家指南],2000。

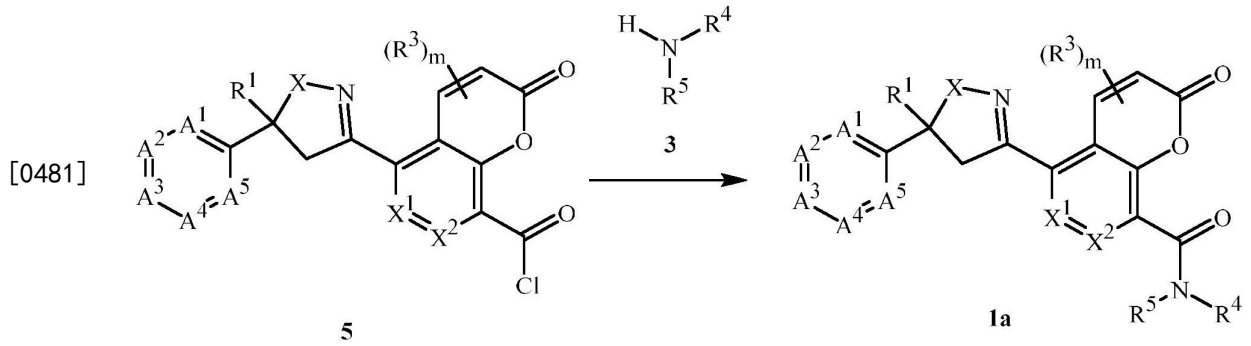
[0476] 如方案2中所示,式1a的化合物也可通过使式4的羧酸与式3的胺在偶联试剂存在下反应来制备。有用的偶联试剂包括例如二环己基碳二亚胺、1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳二亚胺和羰基二咪唑。在该方法中有用的另外的偶联试剂包括0-(7-氮杂苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲六氟磷酸酯(HATU)、2-(1H-苯并三唑-1-基)-1,1,3,3-四甲基脲六氟磷酸酯(HBTU)和丙基膦酸酐(T3P)。这些偶联试剂通常在碱诸如三乙胺、吡啶、4-(二甲基氨基)吡啶或N,N-二异丙基乙胺存在下使用。典型的反应条件包括无水非质子溶剂诸如二氯甲烷、四氢呋喃或N,N-二甲基甲酰胺,以及在室温与70°C之间的反应温度。对于在方案2的方法中有用的反应条件,以及其他公认的偶联条件参见例如Journal of Organic Chemistry[有机化学杂志]2008,73(7),2731-2737;Tetrahedron Letters[四面体通讯]2009,50(45),6200-6202;和Organic letters[有机化学通讯]2011,13(12),2988-91。

[0477] 方案2



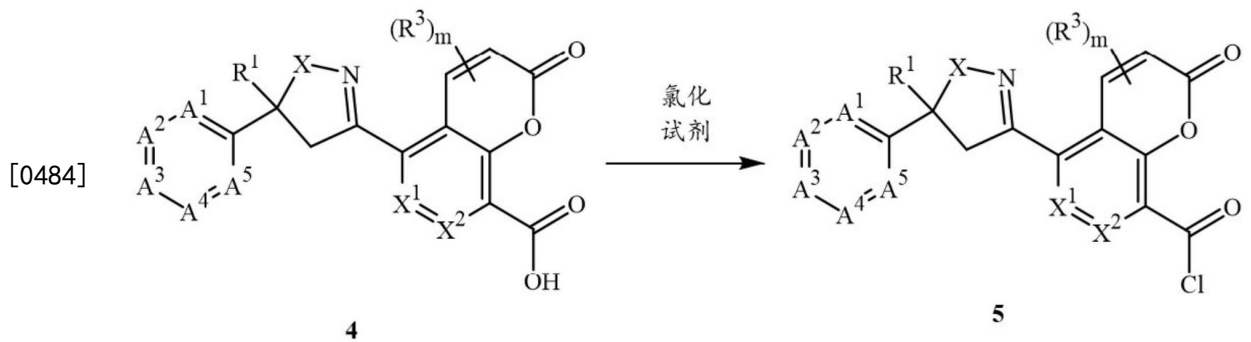
[0479] 可替代地,如方案3中所示,式1a的化合物可通过使式5的酰氯与式3的胺在酸清除剂存在下反应来制备。典型的酸清除剂包括胺碱,诸如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺和吡啶。其他清除剂包括氢氧化物诸如氢氧化钠和氢氧化钾、或碳酸盐诸如碳酸钠和碳酸钾。在某些情况下,使用聚合物支载型酸清除剂诸如聚合物键合型N,N-二异丙基乙胺和聚合物键合型4-(二甲基氨基)吡啶是有用的。

[0480] 方案3



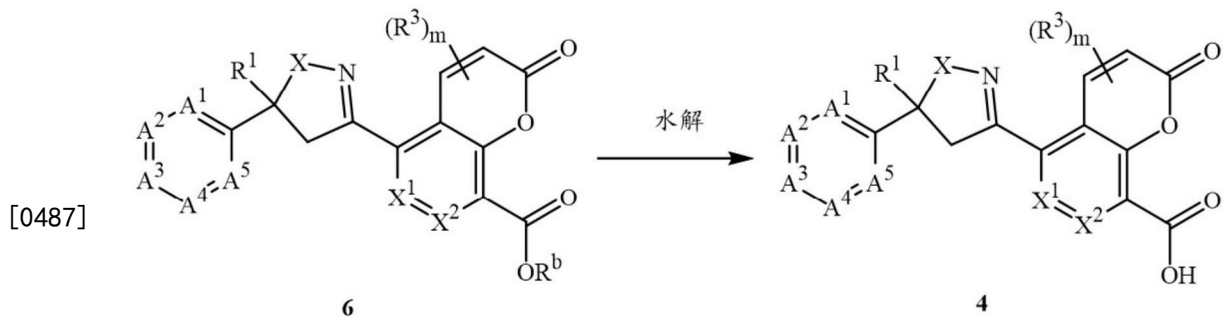
[0482] 式5的酰氯通过许多熟知方法由式4的羧酸容易地制备。例如,使羧酸在溶剂诸如二氯甲烷或甲苯中,并且任选地在催化量的N,N-二甲基甲酰胺的存在下与氯化试剂(诸如亚硫酸氯、草酰氯或氧氯化磷)反应可提供相应的具有式5的酰氯。

[0483] 方案4



[0485] 如方案5中所示,式4的羧酸可以根据使相应的式6的化合物碱性或酸性水解的熟知方法,优选地在水混溶的共溶剂诸如甲醇、乙醇或四氢呋喃中在约25°C与45°C之间的温度下使用略过量的氢氧化物碱(例如氢氧化锂)来制备。可以通过将pH调节至约1至3,并且然后过滤或萃取(任选地在通过蒸发除去有机溶剂之后)来分离产物。

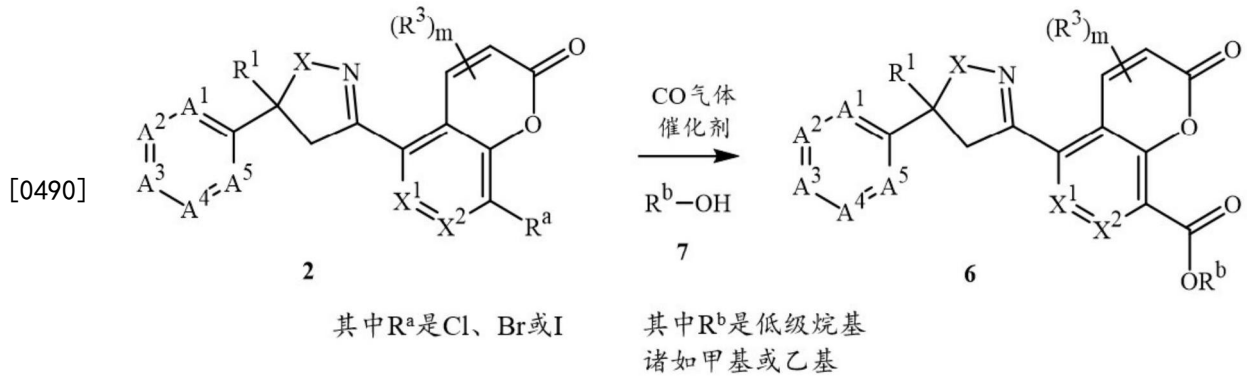
[0486] 方案5



其中R^b是低级烷基
诸如甲基或乙基

[0488] 如方案6中所示,可以用式7的醇代替方案1反应中的式3的胺,以得到式6的酯。

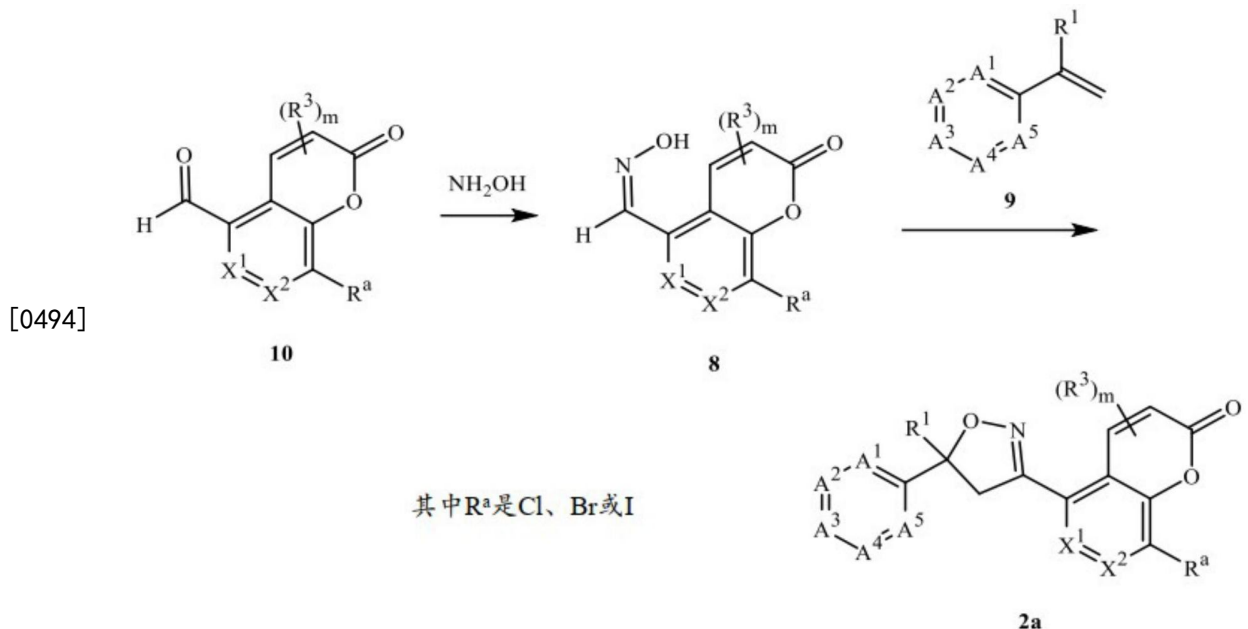
[0489] 方案6



[0491] 如方案7中所概述的,式2a的化合物(即,其中X是O的式2)可以通过两步程序由式10的醛来制备。在第一个步骤中,使式10的醛与羟基胺反应以提供式8的肟。用于该反应的一般程序在化学文献中有记载;参见例如Bioorg. Med. Chem. [生物有机化学与医药化学] 2004, 12, 3965。

[0492] 在第二个步骤中,使式8的肟与式9的苯乙烯反应以产生式2a的化合物。该反应典型地涉及式8的肟的氯化以及随后的脱氯化氢成为腈氧化物,然后使其经受与式9的苯乙烯的1,3-偶极环加成以提供式2a的化合物。在典型的程序中,将氯化试剂诸如次氯酸钠、N-氯代琥珀酰亚胺或氯胺-T与肟在苯乙烯存在下组合。为了促进脱氯化氢步骤,可能需要在碱性条件下进行该反应。典型的碱包括碳酸氢钠、吡啶和三乙胺。该反应可以在多种溶剂(包括四氢呋喃、二乙基醚、二氯甲烷、二噁烷、和甲苯)中以范围为从室温至该溶剂的回流温度的温度进行。腈氧化物与烯烃的环加成的一般程序在化学文献中有详细记载,参见例如Synthesis [合成], 1982, 6, 508-509; Tetrahedron [四面体], 2000, 56, 1057-1064; 和EP 1, 538, 138-A1。

[0493] 方案7

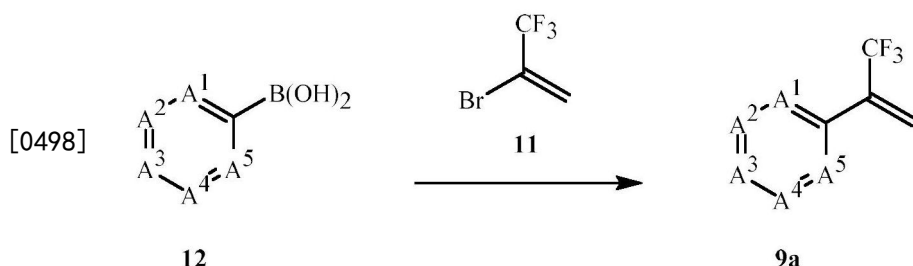


[0495] 本领域技术人员将认识到式6的酯可以与以上方案7中描述的1,3-偶极环加成方法类似地来制备,其中R^a被C(=O)OR^b替代。

[0496] 式9的苯乙烯是可商购的并且可根据本领域技术人员已知的一般方法制备。例如,

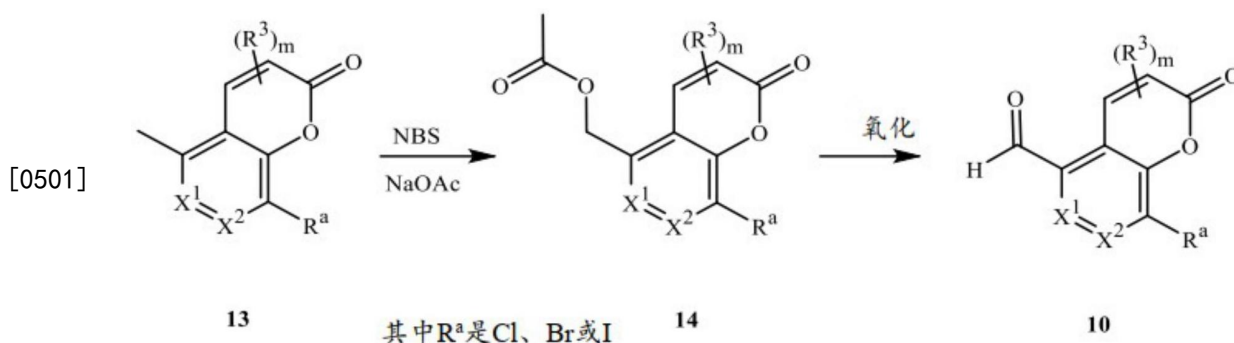
如方案8中所示,式9a的苯乙烯(即,其中R¹是CF₃的式9)可以通过使式12的芳基硼酸与可商购的2-溴-3,3,3-三氟丙烯(式11)进行钯催化的偶联来制备。用于该反应的一般程序在化学文献中有记载;参见例如,J. Fluorine Chemistry [氟化学杂志], 1999, 95, 167-170。

[0497] 方案8



[0499] 式10的醛可以通过本领域已知的多种方法来制备,参见例如Bioorg. Med. Chem. Lett. [生物有机化学与医药化学通讯] 2007, 17, 902和EP 2049481 A2,以及其中引用的参考文献。如方案9中所示,式10的醛可以通过以下方式制备:使用溴化剂如N-溴代琥珀酰亚胺(NBS)在乙酸钠和自由基引发剂诸如过氧化苯甲酰的存在下使式13的化合物溴化,以给出式14的乙酸酯,然后将其通过酯化和氧化转化为式10的醛。

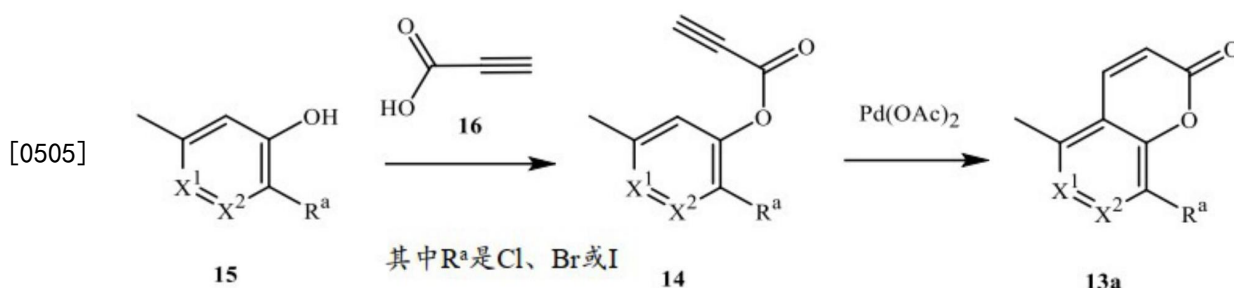
[0500] 方案9



[0502] 式13的化合物是可商购的并且可根据本领域技术人员已知的一般方法制备。如方案10中所概述的,式13a的化合物(即,其中m是0的式13)可以在两个步骤中由式15的化合物来制备。在第一个步骤中,式14的化合物可使式15的化合物与式16的羧酸在偶联试剂如二环己基碳二亚胺存在下反应来制备。

[0503] 在第二个步骤中,将式14的化合物用钯催化剂诸如乙酸钯处理以获得式13a的化合物。用于该反应的一般程序在化学文献中有记载;参见例如,Science [科学], 2000, 287 (5460), 1992-1995。

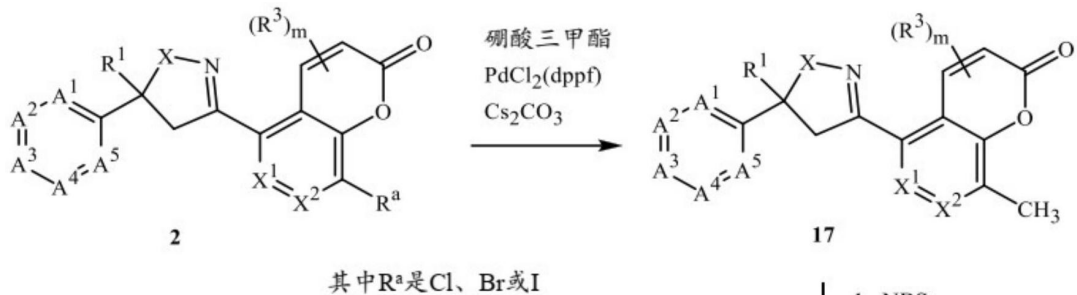
[0504] 方案10



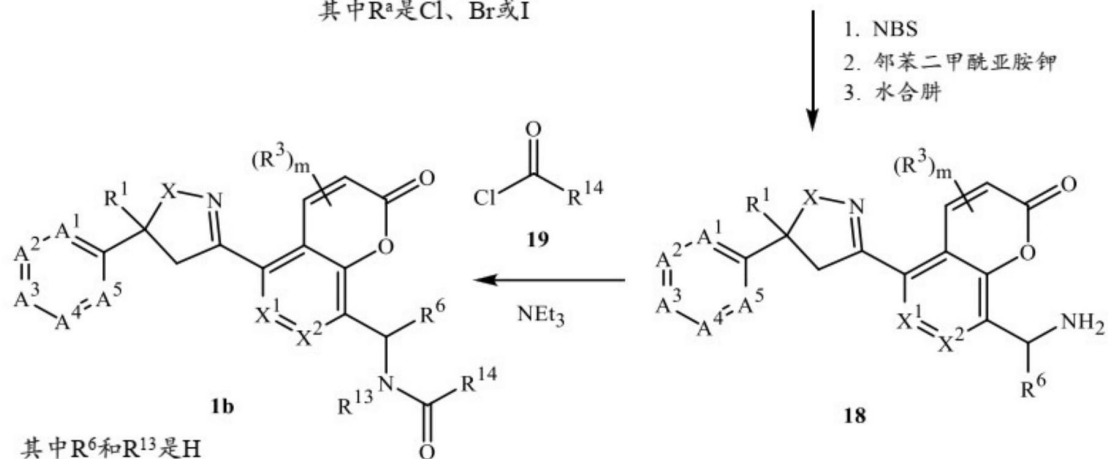
[0506] 式1b的化合物(即,其中G是G-1, J是CH(R⁶)N(R¹³)C(=Z)R¹⁴, R⁶是H并且R¹³是H的式

1) 可以根据本领域技术人员已知的一般方法在如方案11中所概述的步骤中制备。在第一个步骤中,使式2的化合物甲基化以形成式17的化合物。式17的化合物的胺化提供了式18的化合物。将式18的化合物用式19的酰氯处理以提供式1b的化合物。

[0507] 方案11

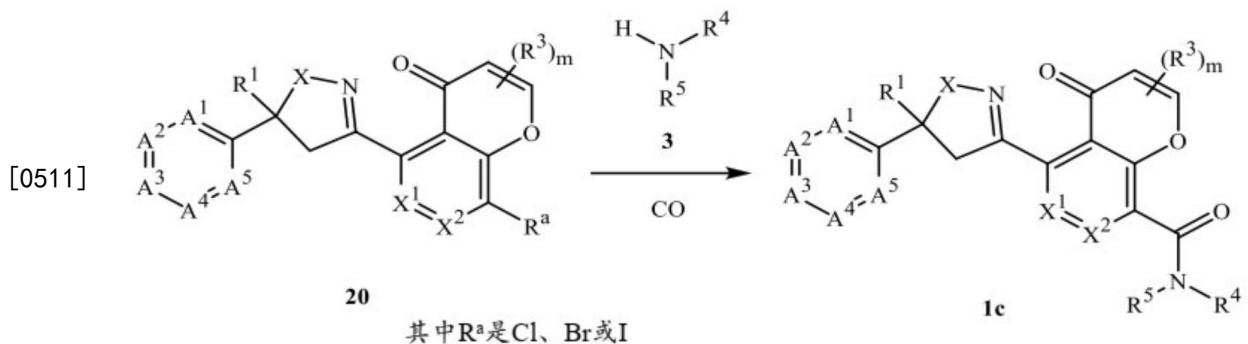


[0508]



[0509] 如方案12中所示,式1c的化合物(即,其中G是G-2,J是 $C(=Z)NR^4R^5$ 并且Z是O的式1)可以通过用式3的胺使式20的芳基卤化物(其中 R^a 是Cl、Br或I)进行氨基羰基化来制备。

[0510] 方案12

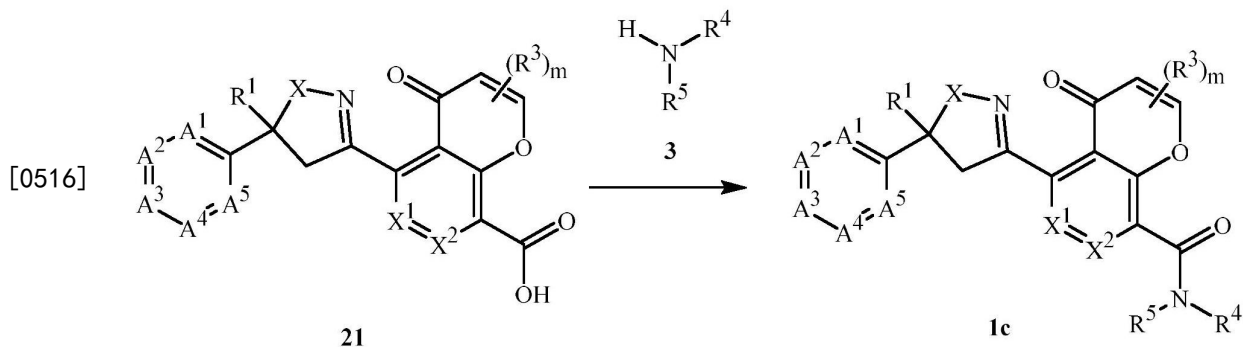


[0512] 该反应典型地用式20的芳基溴化物(其中X是Br)在钯催化剂的存在下在CO气氛下进行。用于本发明方法的钯催化剂典型地包含以形式氧化态为0(即Pd(0))或2(即Pd(II))的钯。多种此类含钯化合物和络合物可用作本发明方法的催化剂。在方案1的方法中可用作催化剂的含钯化合物和络合物的实例包括 $PdCl_2(PPh_3)_2$ (即,双(三苯基膦)二氯化钯(II))、 $Pd_2(dba)_3$ (即,三(二亚苄基丙酮)二钯(0))、 $Pd(PPh_3)_4$ (即,四(三苯基膦)钯(0))、 $Pd(C_5H_7O_2)_2$ (即,乙酰丙酮钯(II))和二氯-[1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁]钯(II)。方案1的方法通常在液相中进行,并且因此为了最有效,钯催化剂优选在液相中具有良好的溶解度。有用的溶剂包括例如醚诸如1,2-二甲氧基乙烷、酰胺诸如N,N-二甲基乙酰胺和非卤化芳族烃诸如甲苯。

[0513] 方案12的方法可以在广泛范围的温度(范围为从约25°C至约150°C)内进行。值得注意的是从约60°C至约110°C的温度,这典型地提供了更快的反应速率和更高的产物产率。用于用芳基溴化物和胺进行氨基羰基化的一般方法和程序在文献中是熟知的;参见,例如, H.Horino等人, *Synthesis* [合成] 1989, 715; 和 J.J.Li, G.W.Gribble, 编辑, *Palladium in Heterocyclic Chemistry: A Guide for the Synthetic Chemist* [杂环化学中的钯: 合成化学家指南], 2000。

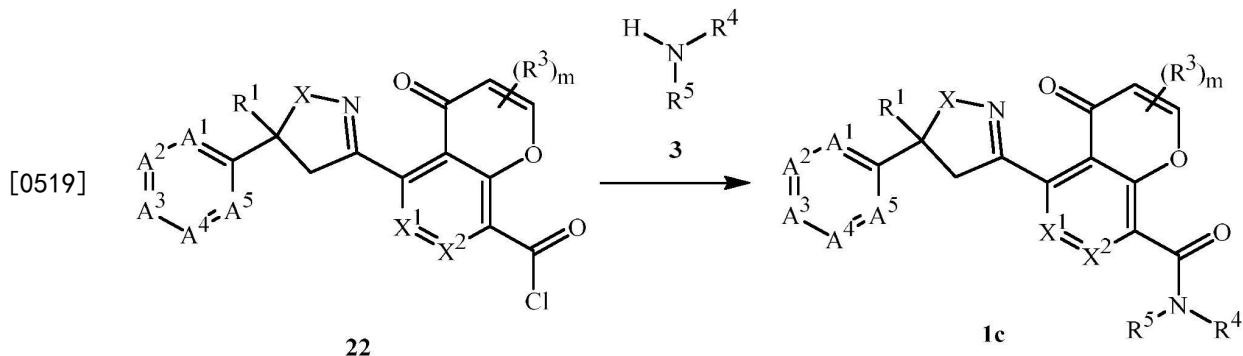
[0514] 如方案13中所示, 式1c的化合物也可通过使式21的羧酸与式3的胺在偶联试剂存在下反应来制备。有用的偶联试剂包括例如二环己基碳二亚胺、1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳二亚胺和羰基二咪唑。在该方法中有用的另外的偶联试剂包括0-(7-氮杂苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲六氟磷酸酯(HATU)、2-(1H-苯并三唑-1-基)-1,1,3,3-四甲基脲六氟磷酸酯(HBTU)和丙基膦酸酐(T3P)。这些偶联试剂通常在碱诸如三乙胺、吡啶、4-(二甲基氨基)吡啶或N,N-二异丙基乙胺存在下使用。典型的反应条件包括无水非质子溶剂诸如二氯甲烷、四氢呋喃或N,N-二甲基甲酰胺, 以及在室温与70°C之间的反应温度。对于在方案13的方法中有用的反应条件, 以及其他公认的偶联条件参见例如 *Journal of Organic Chemistry* [有机化学杂志] 2008, 73 (7), 2731-2737; *Tetrahedron Letters* [四面体通讯] 2009, 50 (45), 6200-6202; 和 *Organic letters* [有机化学通讯] 2011, 13 (12), 2988-91。

[0515] 方案13



[0517] 可替代地, 如方案14中所示, 式1c的化合物可通过使式22的酰氯与式3的胺在酸清除剂存在下反应来制备。典型的酸清除剂包括胺碱, 诸如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺和吡啶。其他清除剂包括氢氧化物诸如氢氧化钠和氢氧化钾、或碳酸盐诸如碳酸钠和碳酸钾。在某些情况下, 使用聚合物支载型酸清除剂诸如聚合物键合型N,N-二异丙基乙胺和聚合物键合型4-(二甲基氨基)吡啶是有用的。

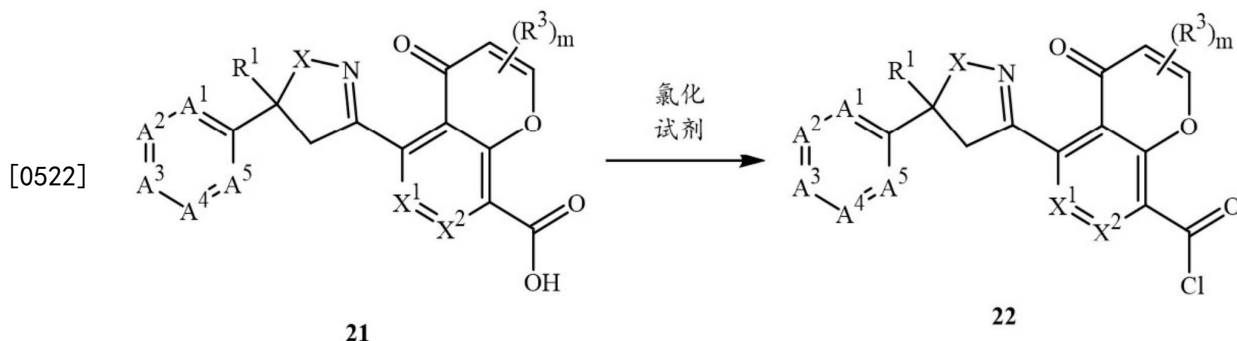
[0518] 方案14



[0520] 式22的酰氯通过许多熟知方法由式21的羧酸容易地制备。例如, 使羧酸在溶剂诸如

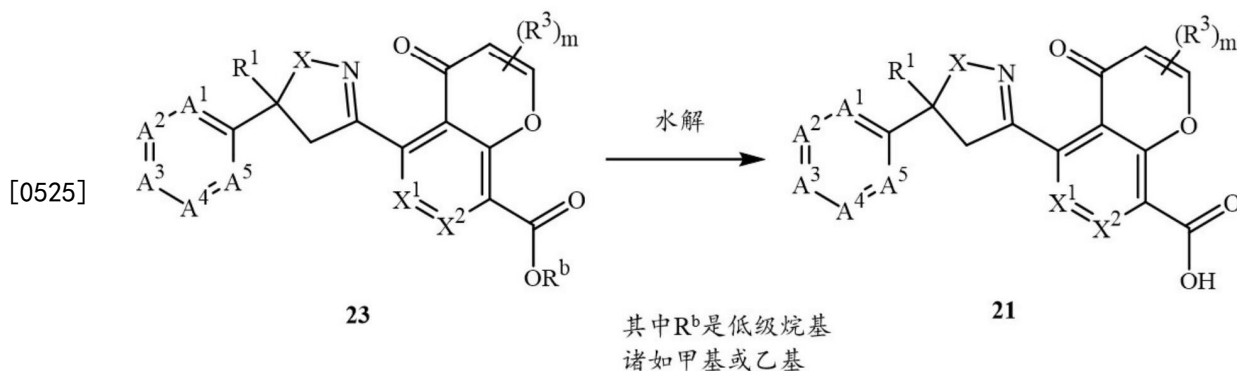
如二氯甲烷或甲苯中,并且任选地在催化量的N,N-二甲基甲酰胺的存在下与氯化试剂(诸如亚硫酸氯、草酰氯或氧氯化磷)反应可提供相应的具有式22的酰氯。

[0521] 方案15



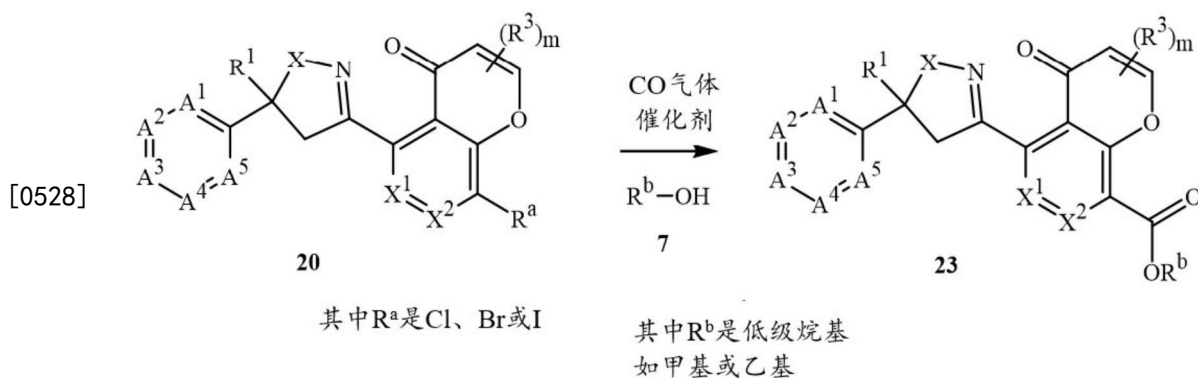
[0523] 如方案16中所示,式21的羧酸可以根据使相应的式23的化合物碱性或酸性水解的熟知方法,优选地在水混溶的共溶剂诸如甲醇、乙醇或四氢呋喃中在约25°C与45°C之间的温度下使用略过量的氢氧化物碱(例如氢氧化锂)来制备。可以通过将pH调节至约1至3,并且然后过滤或萃取(任选地在通过蒸发除去有机溶剂之后)来分离产物。

[0524] 方案16



[0526] 如方案17中所示,可以用式7的醇代替方案12反应中的式3的胺,以得到式23的酯。

[0527] 方案17

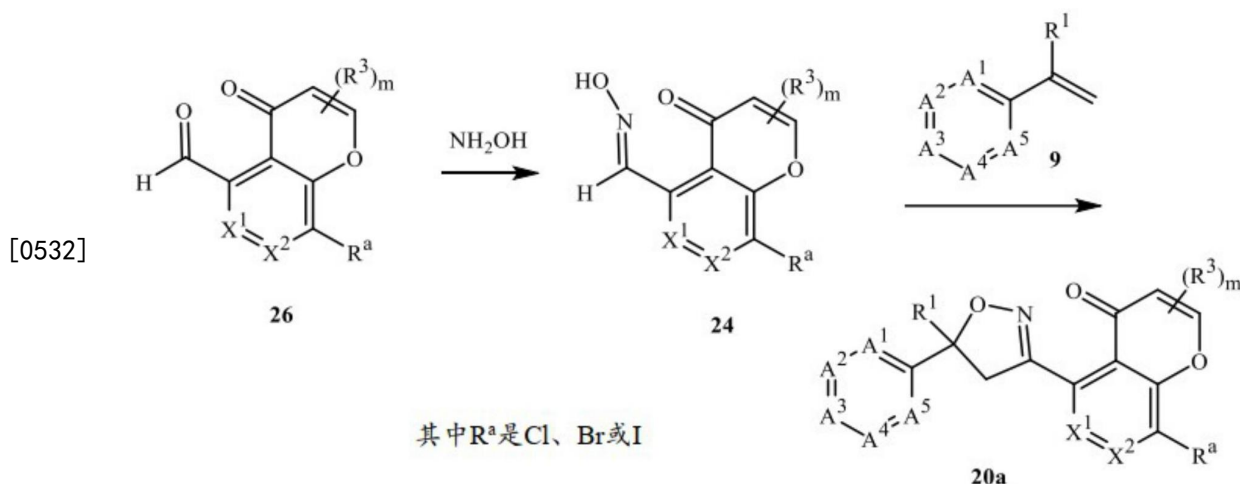


[0529] 如方案18中所概述的,式20a的化合物(即,其中X是O的式2)可以通过两步程序由式26的醛来制备。在第一个步骤中,使式26的醛与羟基胺反应以提供式24的肟。用于该反应的一般程序在化学文献中有记载;参见例如Bioorg. Med. Chem. [生物有机化学与医药化学] 2004, 12, 3965。

[0530] 在第二个步骤中,使式24的肟与式9的苯乙烯反应以产生式20a的化合物。该反应

典型地涉及式24的肟的氯化以及随后的脱氯化氢成为腈氧化物,然后使其经受与式9的苯乙烯的1,3-偶极环加成以提供式20a的化合物。在典型的程序中,将氯化试剂诸如次氯酸钠、N-氯代琥珀酰亚胺或氯胺-T与肟在苯乙烯存在下组合。为了促进脱氯化氢步骤,可能需要在碱性条件下进行该反应。典型的碱包括碳酸氢钠、吡啶和三乙胺。该反应可以在多种溶剂(包括四氢呋喃、二乙基醚、二氯甲烷、二噁烷、和甲苯)中以范围为从室温至该溶剂的回流温度的温度进行。腈氧化物与烯烃的环加成的一般程序在化学文献中有详细记载,参见例如Synthesis[合成],1982,6,508-509;Tetrahedron[四面体],2000,56,1057-1064;和EP 1,538,138-A1。

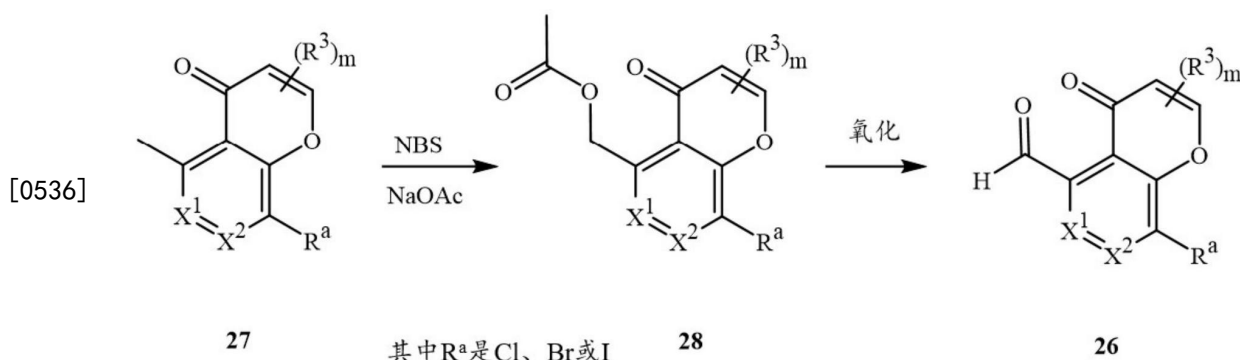
[0531] 方案18



[0533] 本领域技术人员将认识到式23的酯可以与以上方案18中描述的1,3-偶极环加成方法类似地来制备,其中R^a被C(=O)OR^b替代。

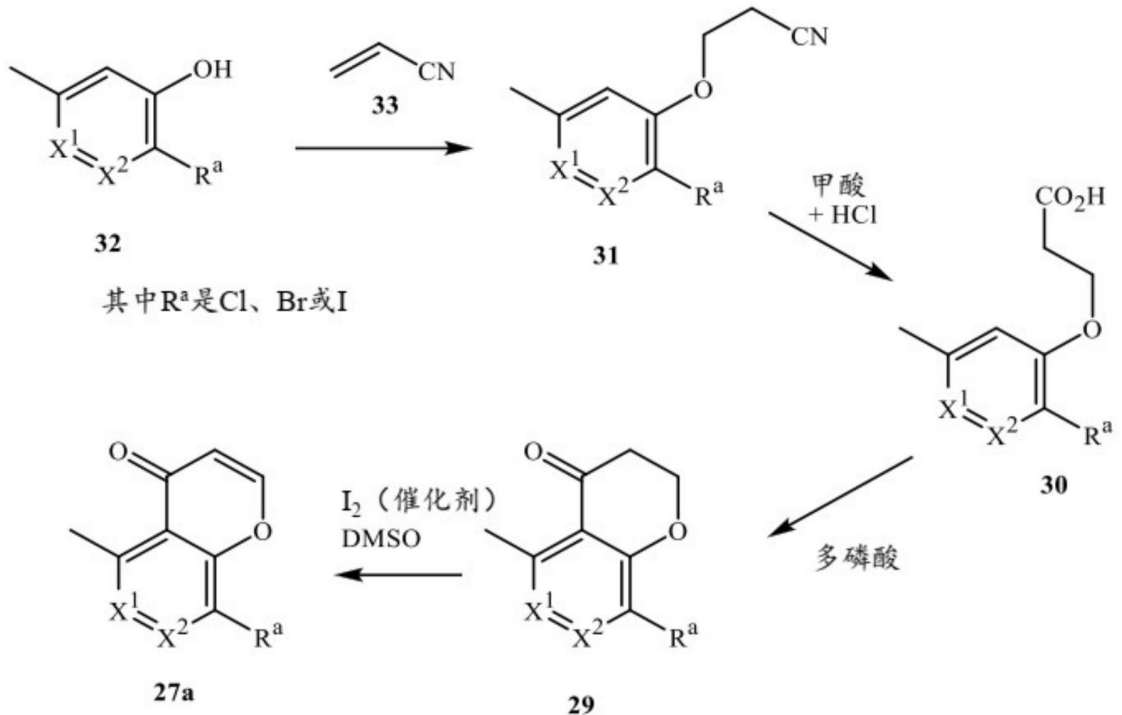
[0534] 式26的醛可以通过本领域已知的多种方法来制备,参见例如Bioorg.Med.Chem.Lett.[生物有机化学与医药化学通讯]2007,17,902和EP 2049481 A2,以及其中引用的参考文献。如方案19中所示,式26的醛可以通过以下方式制备:使用溴化剂如N-溴代琥珀酰亚胺(NBS)在乙酸钠和自由基引发剂诸如过氧化苯甲酰的存在下使式27的化合物溴化,以给出式28的乙酸酯,然后将其通过酯化和氧化转化为式26的醛。

[0535] 方案19



[0537] 式27a的化合物(即,其中m是0的式27)可以根据本领域技术人员已知的一般方法在如方案20中所概述的步骤中制备。用于该步骤序列的一般程序在化学文献中有记载;参见例如,Australian J.of Chem.[澳大利亚化学杂志]2010,63(11),1582-1593。式32的化合物是可商购的并且可根据本领域技术人员已知的一般方法制备。

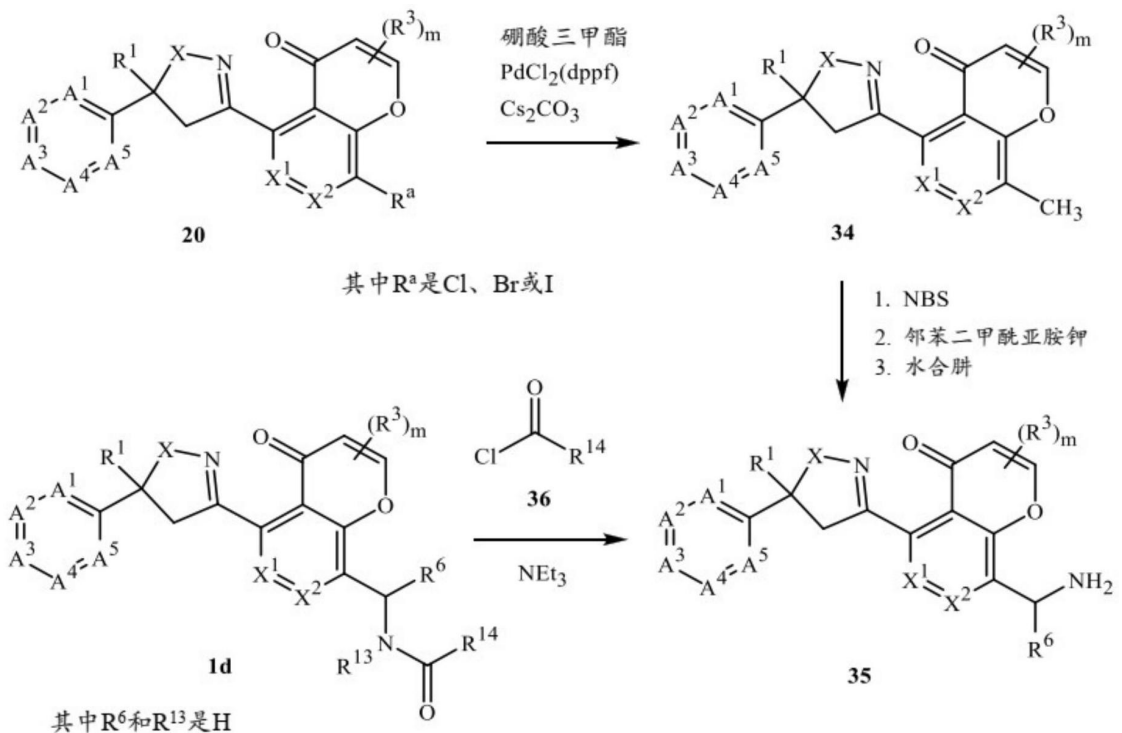
[0538] 方案20



[0539]

[0540] 式1d的化合物(即,其中G是G-2,J是 $\text{CH}(\text{R}^6)\text{N}(\text{R}^{13})\text{C}(=\text{Z})\text{R}^{14}$, R^6 是H并且 R^{13} 是H的式1)可以根据本领域技术人员已知的一般方法在如方案21中所概述的步骤中制备。在第一个步骤中,使式20的化合物甲基化以形成式34的化合物。式34的化合物的胺化提供了式35的化合物。将式18的化合物用式36的酰氯处理以提供式1b的化合物。

[0541] 方案21



[0542]

[0543] 通过上述方法制备的式1的化合物(其中Z是O)可使用多种标准硫化试剂诸如五硫化磷或2,4-双(4-甲氧基苯基)-1,3-二硫杂-2,4-二磷烷-2,4-二硫化物(劳森(Lawesson))

试剂) 转化为相应的硫代酰胺(其中Z是S)。这类反应是熟知的, 参见, 例如, Heterocycles [杂环化合物] 1995, 40, 271-278; J. Med. Chem. [药物化学杂志] 2008, 51, 8124-8134; J. Med. Chem. [药物化学杂志] 1990, 33, 2697-706; Synthesis [合成] 1989, (5), 396-3977; J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1 [化学会志柏尔金汇刊1], 1988, 1663-1668; Tetrahedron [四面体] 1988 44, 3025-3036; 和 J. Org. Chem. [有机化学期刊] 1988 53(6), 1323-1326。

[0544] 方案1至21示出了制备具有多种取代基的式1的化合物的方法。具有取代基而不是方案1至21中特别指出的那些取代基的式1的化合物可以通过合成有机化学领域中已知的一般方法(包括类似于方案1至21中所述的方法)来制备。

[0545] 本领域的技术人员认识到, 各种官能团可被转变成其他以提供不同的式1的化合物。式1的化合物或用于其制备的中间体可以含有芳族硝基, 可将芳族硝基还原为氨基, 并且然后经由本领域熟知的反应(例如, 桑德迈尔反应)转化为各种卤化物。通过类似的已知反应, 芳族胺(苯胺)可经由重氮盐转化为苯酚, 然后可将苯酚烷基化以制备具有烷氧基取代基的式1的化合物。同样, 经由桑德迈尔反应制备的芳族卤化物(诸如溴化物或碘化物)可在铜催化条件下与醇反应, 诸如乌尔曼(Ullmann)反应或其已知改性, 以提供含有烷氧基取代基的式1的化合物。另外, 一些卤素基团(诸如氟或氯)可在碱性条件下用醇置换, 以提供含有相应烷氧基取代基的式1的化合物。含有卤基(优选溴基或碘基)的式1的化合物或其前体特别是可用于过渡金属催化的交叉偶联反应以制备式1的化合物的中间体。这些类型的反应在文献中有详细记载; 参见例如, Transition Metal Reagents and Catalysts: Innovations in Organic Synthesis [过渡金属试剂和催化剂: 有机合成中的创新], John Wiley and Sons [约翰威利父子公司], 奇切斯特, 2002中的Tsuji; Palladium in Organic Synthesis [有机合成中的钯], Springer [施普林格公司], 2005中的Tsuji; 以及 Cross Coupling Reactions: A Practical Guide [交叉偶联反应: 实用指南], 2002中的Miyaura和Buchwald; 以及其中引用的参考文献。

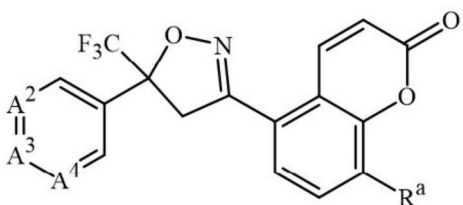
[0546] 应认识到, 上述对于制备式1的化合物所描述的某些试剂和反应条件可能不与中间体中存在的某些官能团相容。在这些情况下, 将保护/去保护序列或官能团相互转化结合到合成中将有助于获得所期望的产物。保护基团的使用和选择对于化学合成领域的技术人员来说将是显而易见的(参见, 例如Greene, T.W.; Wuts, P.G.M. Protective Groups in Organic Synthesis [有机合成中的保护基团], 第2版; 威利出版社: 纽约, 1991)。本领域的技术人员将认识到, 在一些情况下, 在引入各个方案中描绘的试剂后, 可能需要未详细描述额外的常规合成步骤来完成式1的化合物的合成。本领域的技术人员还将认识到, 可能必需以与制备式1的化合物所呈现的具体序列不同的顺序来进行以上方案中示出的步骤的组合。

[0547] 本领域的技术人员还将认识到, 本文所述的式1的化合物和中间体可经受各种亲电反应、亲核反应、自由基反应、有机金属反应、氧化反应和还原反应以添加取代基或改性现有的取代基。

[0548] 可用于制备本披露的化合物的中间体的实例示出于表I-1和表I-6中。

[0549] 表I-1

[0550]



其中R^a是卤素

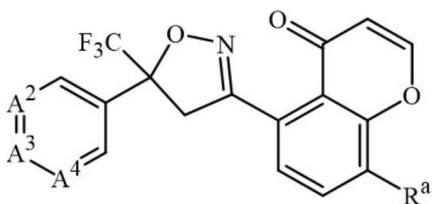
[0551]

A ²	A ³	A ⁴
C-Cl	C-F	C-Cl
C-Cl	C-H	C-Cl
C-CF ₃	C-H	C-H
C-CF ₃	C-F	C-H
C-CF ₃	C-H	C-Cl

[0552]

表I-2

[0553]



其中R^a是卤素

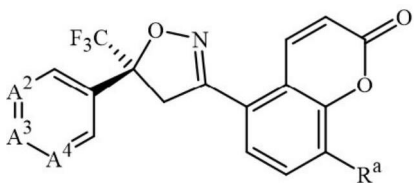
[0554]

A ²	A ³	A ⁴
C-Cl	C-F	C-Cl
C-Cl	C-H	C-Cl
C-CF ₃	C-H	C-H
C-CF ₃	C-F	C-H
C-CF ₃	C-H	C-Cl

[0555]

表I-3

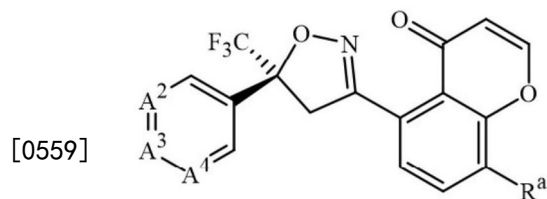
[0556]



其中R^a是卤素

	A ²	A ³	A ⁴
	C-Cl	C-F	C-Cl
	C-Cl	C-H	C-Cl
[0557]	C-CF ₃	C-H	C-H
	C-CF ₃	C-F	C-H
	C-CF ₃	C-H	C-Cl

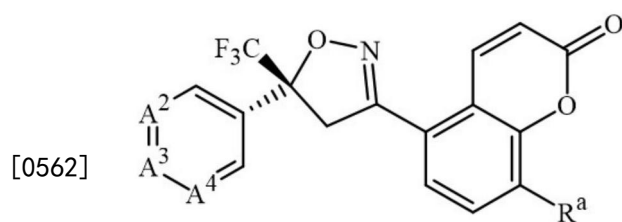
[0558] 表I-4



其中R^a是卤素

	A ²	A ³	A ⁴
	C-Cl	C-F	C-Cl
	C-Cl	C-H	C-Cl
[0560]	C-CF ₃	C-H	C-H
	C-CF ₃	C-F	C-H
	C-CF ₃	C-H	C-Cl

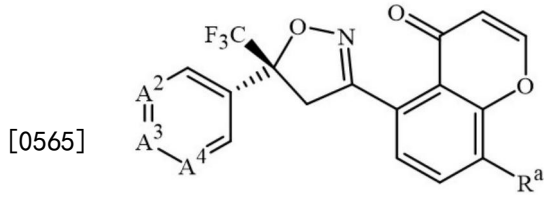
[0561] 表I-5



其中R^a是卤素

	A ²	A ³	A ⁴
	C-Cl	C-F	C-Cl
	C-Cl	C-H	C-Cl
[0563]	C-CF ₃	C-H	C-H
	C-CF ₃	C-F	C-H
	C-CF ₃	C-H	C-Cl

[0564] 表I-6



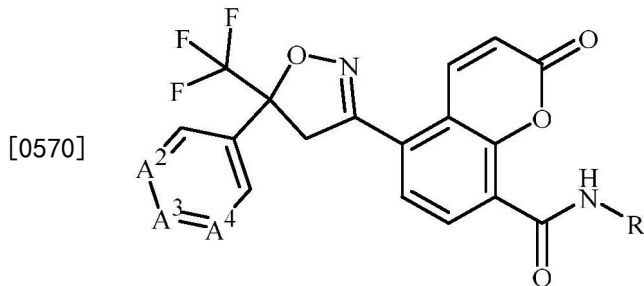
其中R^a是卤素

	A ²	A ³	A ⁴
[0566]	C-Cl	C-F	C-Cl
	C-Cl	C-H	C-Cl
	C-CF ₃	C-H	C-H
	C-CF ₃	C-F	C-H
	C-CF ₃	C-H	C-Cl

[0567] 无需进一步详尽说明,据信本领域技术人员使用前述说明可将本披露利用至其最大程度。

[0568] 通过本文所描述的程序与本领域已知的方法一起,可以制备表1至表10中的下列化合物。以下缩写用于随后的表中:Me意指甲基,OMe意指甲氧基,Et意指乙基,0Et意指乙氧基,n-Pr意指正丙基,i-Pr意指异丙基,c-Pr意指环丙基,n-Bu意指正丁基,s-Bu意指仲丁基,t-Bu意指叔丁基,c-Bu意指环丁基,Ph意指苯基,并且CN意指氰基。


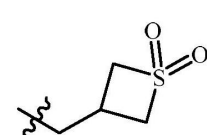
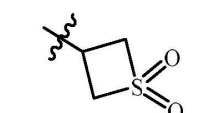
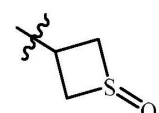
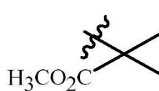
[0569] 表1



[0571] A²是C-Cl,A³是C-F并且A⁴是C-Cl。

	R	R	R
[0572]	Me	Et	n-Pr
	i-Pr	-CH ₂ -c-Pr	-CH(Me)(c-Pr)

[0573] A²是C-Cl,A³是C-F并且A⁴是C-Cl。

R	R	R
Ph	<i>s</i> -Bu	<i>i</i> -Bu
<i>t</i> -Bu	苄基	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(<i>i</i> -Pr)CF ₃	H
-CH=NOMe	-CH=NOEt	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
-CH ₂ CH(OMe) ₂	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Bu
1-甲基环丙-1-基	3-甲氧基环丁-1-基	-CH(Ph)(<i>c</i> -Pr)
1-氟基- <i>c</i> -Pr	1-甲基氮杂环丁烷-3-基	3,3-二氟- <i>c</i> -Bu
-CH ₂ (硫杂环丁烷-3-基)	氧杂环丁烷-3-基	-CH ₂ (氧杂环丙烷-2-基)
硫杂环丁烷-3-基		
[0574]	-CH ₂ (2,2-二-Me-1,3-二氧戊环-4-基)	
	四氢咪喃-2-基	-CH ₂ (四氢咪喃-2-基)
-CH ₂ (咪喃-2-基)	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-CH ₂ (噻吩-2-基)
-CH ₂ (1,3-二氧戊环-2-基)	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH ₂ (2,2-二氟- <i>c</i> -Pr)
	-CH ₂ C(=O)NH ₂	-CH(<i>i</i> -Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(=O)NHCH ₃	-CH ₂ C(=O)NHCH ₂ CF ₃	-CH(Me)C(=O)NH ₂
-CH(Me)C(=O)NHCH ₃	-OCH ₂ - <i>c</i> -Pr	-CH ₂ C(=O)NHCH ₂ C≡CH
-CH(Me)C(=O)NH- <i>t</i> -Bu	-NHC(=O)- <i>i</i> -Pr-	-CH(Me)C(=O)NH ₂
-OCH ₂ CH=CH ₂	-NHC(=O)(吡啶-3-基)	-NHC(=O)CH ₃
-NHCO ₂ CH ₃	-NH- <i>c</i> -己基	-NHC(=O)- <i>t</i> -Bu
-NHC(=O)Ph	-NHC(=O)(噻吩-2-基)	-NHC(=O)NH- <i>i</i> -Pr
-NH- <i>c</i> -Pr	-NHCO ₂ Et	-NHCH ₂ CF ₃
-NHC(=O)CF ₃		

[0575] A²是C-Cl, A³是C-F并且A⁴是C-Cl。

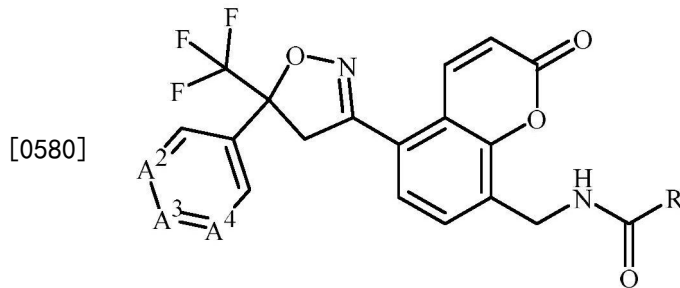
	R	R	R
	-C(=O)C(=O)CH ₃	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃	-NHC(=O)(咪唑-2-基)
	-C(=O)(吡啶-2-基)	-NHC(=O)N(Me) ₂	-C(=O)CO ₂ CH ₃
	-NHC(=O)NHCH ₂ CF ₃	-NHC(=O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NHC(=O)NHCH ₃
[0576]	-NHC(=O)CH ₂ CF ₃	-NHCO ₂ CF ₃	-NHC(=O)CH ₂ CH ₃
	-NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NH(吡啶-2-基)	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃
	-NH(6-CF ₃ -吡啶-2-基)	-NH(4-CF ₃ -吡啶-2-基)	-NH(嘧啶-2-基)
	-CH(Me)NHC(=O)CH ₂ CF ₃	-CH(Me)NHC(=O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH(Me)NHC(=O)CF ₃

[0577] 本披露还包括表2至表5,除了表1中的行标题(即“A²是C-Cl,A³是C-F并且A⁴是C-Cl”)被替换为下文所示的相应行标题之外,每个表的构造与上表1相同。

表 行标题

	2	A ² 是C-Cl, A ³ 是C-H 并且 A ⁴ 是C-Cl。
[0578]	3	A ² 是C-CF ₃ , A ³ 是C-H 并且 A ⁴ 是C-H。
	4	A ² 是C-CF ₃ , A ³ 是C-F 并且 A ⁴ 是C-H。
	5	A ² 是C-CF ₃ , A ³ 是C-H 并且 A ⁴ 是C-Cl。

[0579] 表6



[0581] A²是C-Cl,A³是C-F并且A⁴是C-Cl。

	R	R	R
	Me	Et	<i>n</i> -Pr
[0582]	<i>i</i> -Pr	CH ₂ - <i>c</i> -Pr	-CH(Me)- <i>c</i> -Pr
	<i>t</i> -Bu	Ph	-CH ₂ Ph

[0583] A²是C-Cl,A³是C-F并且A⁴是C-Cl。

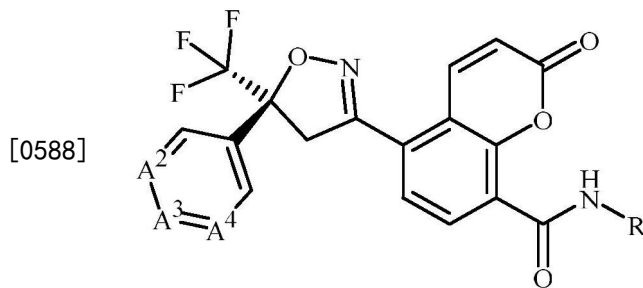
	R	R	R
[0584]	CF ₃	-CH ₂ CF ₃	H
	1-甲基- <i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Bu
	OMe	NHCH ₃	-NHC(=O)CH ₃

[0585] 本披露还包括表7至表10,除了表6中的行标题(即“A²是C-Cl,A³是C-F并且A⁴是C-Cl”)被替换为下文所示的相应行标题之外,每个表的构造与上表6相同。

表 行标题

	7	A ² 是C-Cl, A ³ 是C-H并且A ⁴ 是C-Cl。
[0586]	8	A ² 是C-CF ₃ , A ³ 是C-H并且A ⁴ 是C-H。
	9	A ² 是C-CF ₃ , A ³ 是C-F并且A ⁴ 是C-H。
	10	A ² 是C-CF ₃ , A ³ 是C-H并且A ⁴ 是C-Cl。

[0587] 表11

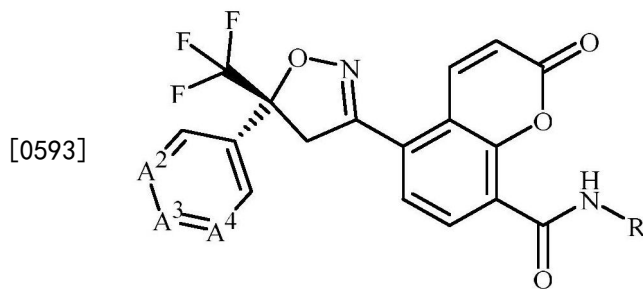


[0589] 除了表1中的结构被替换为以上表11的结构外,表11的构造与表1相同。

[0590] 表12至表15

[0591] 除了表2中的结构被替换为以上表11的结构外,表12的构造与表2相同。表13至表15以与表3至表5相同的方式构造。

[0592] 表16



[0594] 除了表6中的结构被替换为以上表16的结构外,表16的构造与表6相同。

[0595] 表17至表20

[0596] 除了表7中的结构被替换为以上表16的结构外,表17的构造与表7相同。表17至表20以与表7至表10相同的方式构造。

[0597] 制剂/效用

[0598] 本披露的化合物一般将用作组合物(即制剂)中的无脊椎有害生物防治活性成分,

其中至少一种选自由表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂组成的组的附加组分,用作载体。选择该制剂或组合物成分,以与活性成分的物理特性、施用模式和环境因素诸如土壤类型、水分和温度一致。

[0599] 有用的制剂包括液体和固体组合物二者。液体组合物包括任选地可以被稠化成凝胶的溶液(包括可乳化的浓缩物)、悬浮液、乳液(包括微乳液、水包油乳液、可流动的浓缩物和/或悬浮乳液)等。水性液体组合物的一般类型为可溶性浓缩物、悬浮液浓缩物、胶囊悬浮液、浓缩乳液、微乳液、水包油乳液、可流动的浓缩物和悬浮乳液。非水性液体组合物的一般类型为可乳化的浓缩物、可微乳化的浓缩物、可分散的浓缩物和油分散体。

[0600] 固体组合物的一般类型为粉剂、粉末、颗粒剂、球剂、粒料、锭剂、片剂、填充膜(包括种子包衣)等,它们可以是水可分散的(“可湿性的”)或水溶性的。由成膜溶液或可流动的悬浮液形成的膜和包衣特别可用于种子处理。活性成分可以被(微)包封并进一步形成成为悬浮液或固体制剂;可替代地,活性成分的整个制剂可以被包封(或“包衣”)。包封可以控制或延迟活性成分的释放。可乳化的颗粒剂结合了可乳化的浓缩物制剂和干颗粒制剂两者的优点。高强度组合物主要用作进一步制剂的中间体。

[0601] 可喷雾的制剂典型地在喷雾之前分散在合适的介质中。此类液体和固体制剂被配制成在喷雾介质,通常为水,但偶尔是另一种合适介质像芳族烃或石蜡烃或植物油中易于稀释的。喷雾容量的范围可以为每公顷从约一升至几千升,但更典型地为在每公顷从约十至几百升的范围内。可喷雾的制剂可与水或另一种合适的介质桶混,用于通过空气或地面施用来进行叶处理,或用于施用到植株的生长介质中。液体和干制剂可以直接计量加入滴灌系统中,或在种植期间计量加入垄沟中。液体和固体制剂可在种植之前作为种子处理施用到作物和其他期望的植被的种子,以通过内吸吸收保护发育中的根和其他地面下的植株部分和/或叶子。

[0602] 将本文所披露的组合物分散到目标区域(诸如但不限于含有作物的大田)的一种方式是使用无人机。无人机或无人驾驶飞行器(UAV)在农业应用中的用途(诸如用于用化学产品处理大田)正在迅速扩大。化学产品的容器耦合至UAV,并且材料分配系统安装在UAV上,并且UAV在分配化学产品时在待处理区域上方飞行。

[0603] 制剂典型地将含有总计达100重量百分比的在以下近似范围内的有效量的活性成分、稀释剂和表面活性剂。

重量百分比

活性

	成分	稀释剂	表面活性剂	
	水可分散的和可溶性的颗粒剂、片剂和粉末	0.001-90	0-99.999	0-15
[0604]	油分散体、悬浮液、乳液、溶液（包括可乳化的浓缩物）	1-50	40-99	0-50
	粉剂	1-25	70-99	0-5
	颗粒剂和球剂	0.001-99	5-99.999	0-15
	高强度组合物	90-99	0-10	0-2

[0605] 固体稀释剂包括,例如,粘土(诸如膨润土、蒙脱土、凹凸棒石和高岭土)、石膏、纤维素、二氧化钛、氧化锌、淀粉、糊精、糖(例如,乳糖、蔗糖)、二氧化硅、滑石、云母、硅藻土、尿素、碳酸钙、碳酸钠和碳酸氢钠、以及硫酸钠。典型的固体稀释剂在Watkins等人, Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers[杀昆虫剂粉剂稀释剂和载体手册],第2版,Dorland Books,Caldwell,New Jersey[考德威尔,新泽西州]中有所描述。

[0606] 液体稀释剂包括,例如水、N,N-二甲基烷酰胺(例如,N,N-二甲基甲酰胺)、柠檬烯、二甲基亚砷、N-烷基吡咯烷酮(例如,N-甲基吡咯烷酮)、磷酸烷基酯(例如,磷酸三乙酯)、乙二醇、三甘醇、丙二醇、二丙二醇、聚丙二醇、碳酸亚丙酯、碳酸亚丁酯、石蜡(例如白矿物油、正链烷烃、异链烷烃)、烷基苯、烷基萘、甘油、三乙酸甘油酯、山梨醇、芳烃、脱芳构化脂族化合物、烷基苯、烷基萘、酮,诸如环己酮、2-庚酮、异佛尔酮和4-羟基-4-甲基-2-戊酮,乙酸酯,诸如乙酸异戊酯、乙酸己酯、乙酸庚酯、乙酸辛酯、乙酸壬酯、乙酸十三烷基酯和乙酸异冰片酯,其他酯,诸如烷基化乳酸酯、二元酯、苯甲酸烷基和芳基酯、 γ -丁内酯,以及可以是直链、支链、饱和或不饱和的醇,诸如甲醇、乙醇,正丙醇、异丙醇、正丁醇、异丁醇、正己醇、2-乙基己醇、正辛醇、癸醇、异癸醇、异十八烷醇、鲸蜡醇、月桂醇、十三烷醇、油醇、环己醇、四氢糠醇、双丙酮醇、甲酚和苜醇。液体稀释剂还包括饱和的和不饱和的脂肪酸(典型地 C_6 - C_{22})的甘油酯,诸如植物种子和果实油(例如,橄榄油、蓖麻油、亚麻籽油、芝麻油、玉米油(玉蜀黍油)、花生油、葵花籽油、葡萄籽油、红花油、棉籽油、大豆油、油菜籽油、椰子油和棕榈仁油),动物源脂肪(例如,牛脂、猪脂、猪油、鱼肝油、鱼油),以及其混合物。液体稀释剂还包括烷基化(例如甲基化、乙基化、丁基化)脂肪酸,其中脂肪酸可以通过来自植物和动物来源的甘油酯的水解获得,并且可通过蒸馏纯化。典型的液体稀释剂在Marsden,Solvents Guide[溶剂指南],第2版,Interscience,New York[纽约],1950中进行描述。

[0607] 本披露的固体和液体组合物经常包括一种或多种表面活性剂。当添加到液体中时,表面活性剂(surfactant,也称为“表面活性剂(surface-active agent)”)通常改变、最经常地降低液体的表面张力。根据表面活性剂分子中的亲水和亲脂基团的性质,表面活性

剂可用作润湿剂、分散剂、乳化剂或消泡剂。

[0608] 表面活性剂可以分为非离子的、阴离子的或阳离子的。可用于本发明组合物的非离子表面活性剂包括但不限于：醇烷氧基化物，诸如基于天然醇和合成醇（其可以是支链或直链的）并且由醇和环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或其混合物制备的醇烷氧基化物；胺乙氧基化物、链烷醇酰胺和乙氧基化链烷醇酰胺；烷氧基化甘油三酯，诸如乙氧基化的大豆油、蓖麻油和油菜籽油；烷基酚烷氧基化物，诸如辛基酚乙氧基化物、壬基酚乙氧基化物、二壬基酚乙氧基化物和十二烷基酚乙氧基化物（由苯酚和环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或其混合物制备）；由环氧乙烷或环氧丙烷制备的嵌段聚合物和其中末端嵌段由环氧丙烷制备的反式嵌段聚合物；乙氧基化脂肪酸；乙氧基化脂肪酯和油；乙氧基化甲酯；乙氧基化三苯乙氧基酚（包括由环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或其混合物制备的那些）；脂肪酸酯、甘油酯、羊毛脂基衍生物、聚乙氧基化酯（诸如聚乙氧基化脱水山梨糖醇脂肪酸酯、聚乙氧基化山梨糖醇脂肪酸酯和聚乙氧基化甘油脂肪酸酯）；其他脱水山梨糖醇衍生物诸如脱水山梨糖醇酯；聚合物表面活性剂，诸如无规共聚物、嵌段共聚物、醇酸peg（聚乙二醇）树脂、接枝或梳形聚合物以及星形聚合物；聚乙二醇（peg）；聚乙二醇脂肪酸酯；硅酮基表面活性剂；和糖衍生物，诸如蔗糖酯、烷基多糖苷和烷基多糖。

[0609] 有用的阴离子表面活性剂包括但不限于：烷基芳基磺酸及其盐；羧化的醇或烷基酚乙氧基化物；二苯基磺酸酯衍生物；木质素和木质素衍生物，诸如木质素磺酸盐；马来酸或琥珀酸或它们的酸酐；烯烴磺酸酯；磷酸酯，诸如醇烷氧基化物的磷酸酯，烷基酚烷氧基化物的磷酸酯和苯乙氧基酚乙氧基化物的磷酸酯；蛋白质基表面活性剂；肌氨酸衍生物；苯乙氧基酚醚硫酸盐；油和脂肪酸的硫酸盐和磺酸盐；乙氧基化烷基酚的硫酸盐和磺酸盐；醇的硫酸盐；乙氧基化醇的硫酸盐；胺和酰胺的磺酸盐，诸如N,N-烷基牛磺酸盐；苯、枯烯、甲苯、二甲苯以及十二烷基苯和十三烷基苯的磺酸盐；缩聚萘的磺酸盐；萘和烷基萘的磺酸盐；石油级份的磺酸盐；磺基琥珀酰胺酸盐；以及磺基琥珀酸盐和它们的衍生物，诸如二烷基磺基琥珀酸盐。

[0610] 有用的阳离子表面活性剂包括但不限于：酰胺和乙氧基化酰胺；胺诸如N-烷基丙二胺、三亚丙基三胺和二亚丙基四胺，和乙氧基化胺、乙氧基化二胺以及丙氧基化胺（由胺和环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或它们的混合物制备）；胺盐诸如乙酸铵和二胺盐；季铵盐诸如季盐、乙氧基化季盐和二季盐；以及胺氧化物，诸如烷基二甲基胺氧化物和双-(2-羟乙基)-烷基胺氧化物。

[0611] 还可用于本发明组合物的非离子表面活性剂和阴离子表面活性剂的混合物、或非离子表面活性剂和阳离子表面活性剂的混合物。非离子表面活性剂、阴离子表面活性剂和阳离子表面活性剂以及它们的推荐用途披露于多个已披露的参考文献中，包括由The Manufacturing Confectioner Publishing Co. [糖果制造商出版公司]，McCutcheon分部出版的McCutcheon's Emulsifiers and Detergents [McCutcheon的乳化剂和清洁剂]，annual American and International Editions [美国和国际年度版]；Sisely和Wood，Encyclopedia of Surface Active Agents [表面活性剂百科全书]，Chemical Publ. Co., Inc. [化学出版有限公司]，纽约，1964；以及A.S. Davidson和B. Milwidsky，Synthetic Detergents [合成洗涤剂]，第七版，John Wiley and Sons [约翰威利父子公司]，纽约，1987。

[0612] 本披露的组合物还可包含本领域技术人员已知为辅助制剂的制剂助剂和添加剂(其中一些也可被认为是起到固体稀释剂、液体稀释剂或表面活性剂作用)。此类制剂助剂和添加剂可控制:pH(缓冲剂)、加工过程中的起泡(消泡剂,诸如聚有机硅氧烷)、活性成分的沉降(悬浮剂)、粘度(触变增稠剂)、容器内的微生物生长(抗微生物剂)、产品冷冻(防冻剂)、颜色(染料/颜料分散体)、洗脱(成膜剂或粘着剂)、蒸发(蒸发阻滞剂)、以及其他制剂属性。成膜剂包括例如聚乙酸乙烯酯、聚乙酸乙烯酯共聚物、聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯酯共聚物、聚乙烯醇、聚乙烯醇共聚物和蜡。制剂助剂和添加剂的实例包括以下中列出的那些:由Manufacturing Confectioner出版公司的McCutcheon分部出版的McCutcheon's Volume 2:Functional Materials[McCutcheon的第2卷:功能材料],annual International and North American editions[国际和北美年度版];和PCT公开WO 03/024222。

[0613] 典型地通过将活性成分溶于溶剂中或者通过在液体或干稀释剂中研磨将式1的化合物和任何其他活性成分掺入本发明组合物中。可通过简单地混合这些成分来制备包括可乳化的浓缩物的溶液。如果旨在用作可乳化的浓缩物的液体组合物的溶剂是与水不混溶的,则典型地添加乳化剂以使含有活性成分的溶剂在用水稀释时乳化。粒径最高达2,000 μm 的活性成分浆料可以使用介质磨机进行湿法碾磨,以得到平均粒径低于3 μm 的颗粒。水性浆料可以制成成品悬浮剂(参见,例如,U.S.3,060,084)或通过喷雾干燥进一步加工以形成水可分散的颗粒剂。干制剂通常需要干碾磨过程,产生在2至10 μm 范围内的平均粒径。粉剂和粉末可以通过共混并且通常通过研磨(例如用锤磨机或流能磨)来制备。可以通过将活性物质喷雾在预成形的颗粒剂载体上或者通过附聚技术来制备颗粒剂和球剂。参见,Browning,“Agglomeration[附聚]”,Chemical Engineering[化学工程],1967年12月4日,第147-48页;Perry's Chemical Engineer's Handbook[佩里化学工程师手册],第4版,McGraw-Hill[麦格劳希尔集团],纽约,1963,第8-57页及其后页,以及WO 91/13546。球剂可以如U.S.4,172,714中所述制备。水可分散的和可溶性的颗粒剂可如在U.S.4,144,050、U.S.3,920,442和DE 3,246,493中教导的来制备。片剂可以如在U.S.5,180,587、U.S.5,232,701和U.S.5,208,030中所教导的来制备。膜可以如在GB 2,095,558和U.S.3,299,566中所教导的来制备。

[0614] 关于制剂领域的进一步信息,参见T.S.Woods,Pesticide Chemistry and Bioscience,The Food-Environment Challenge[农药化学与生物科学,食品与环境挑战]中的“The Formulator's Toolbox-Product Forms for Modern Agriculture[制剂工具箱-现代农业产品形式]”,T.Brooks和T.R.Roberts编辑,Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry[第九届农药化学国际会议论文集],The Royal Society of Chemistry[英国皇家化学学会],剑桥,1999,第120-133页。还参见U.S.3,235,361,第6栏,第16行至第7栏,第19行和实例10-41;U.S.3,309,192,第5栏,第43行至第7栏,第62行和实例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138-140、162-164、166、167和169-182;U.S.2,891,855,第3栏,第66行至第5栏,第17行和实例1-4;Klingman,Weed Control as a Science[杂草控制科学],John Wiley and Sons,Inc.[约翰威利父子公司],纽约,1961,第81-96页;Hance等人,Weed Control Handbook[杂草防治手册],第8版,Blackwell Scientific Publications[布莱克威尔科学出版社],牛津,1989;和

Developments in formulation technology[制剂技术的发展],PJB Publications[PJB出版公司],英国里士满,2000。

[0615] 在以下实例中,所有制剂均以常规的方式制备。化合物编号是指索引表A中的化合物。无需进一步详尽说明,据信本领域技术人员使用前述说明可将本披露利用至其最大程度。因此,以下实例应被解释为仅是说明性的,并且不以任何方式限制本披露。除非另外说明,否则百分比按重量计。

[0616] 实例A

[0617] 高强度浓缩物

[0618] 化合物1 98.5%

[0619] 二氧化硅气凝胶 0.5%

[0620] 合成无定形精细二氧化硅 1.0%

[0621] 实例B

[0622] 可湿性粉末

化合物 1 65.0%

十二烷基酚聚乙二醇醚 2.0%

[0623] 木质素磺酸钠 4.0%

硅铝酸钠 6.0%

蒙脱土(煅烧的) 23.0%

[0624] 实例C

[0625] 颗粒剂

[0626] 化合物1 10.0%

[0627] 凹凸棒石颗粒剂(低挥发性物质,0.71/0.30mm;U.S.S.号25-50筛) 90.0%号

[0628] 实例D

[0629] 挤出球剂

化合物 1 25.0%

无水硫酸钠 10.0%

[0630] 粗木质素磺酸钙 5.0%

烷基萘磺酸钠 1.0%

钙/镁膨润土 59.0%

[0631] 实例E

[0632] 可乳化的浓缩物

[0633] 化合物1 10.0%

[0634] 聚氧乙烯山梨醇六油酸酯 20.0%

[0635] C₆-C₁₀脂肪酸甲酯 70.0%

[0636] 实例F

[0637]	<u>微乳液</u>	
	化合物 1	5.0%
	聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯酯共聚物	30.0%
[0638]	烷基多糖苷	30.0%
	单油酸甘油酯	15.0%
	水	20.0%
[0639]	<u>实例G</u>	
[0640]	<u>种子处理</u>	
	化合物 1	20.00%
	聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯酯共聚物	5.00%
	褐煤酸蜡	5.00%
	木质素磺酸钙	1.00%
[0641]	聚氧乙烯/聚氧丙烯嵌段共聚物	1.00%
	硬脂醇 (POE 20)	2.00%
	聚有机硅氧烷	0.20%
	着色剂红染料	0.05%
	水	65.75%
[0642]	<u>实例H</u>	
[0643]	<u>肥料棒</u>	
	化合物 1	2.5%
	吡咯烷酮-苯乙烯共聚物	4.8%
	三苯乙烯基苯基 16-乙氧基化物	2.3%
[0644]	滑石	0.8%
	玉米淀粉	5.0%
	缓释肥料	36.0%
	高岭土	38.0%
[0645]	水	10.6%
[0646]	<u>实例I</u>	
[0647]	<u>悬浮剂</u>	

	化合物 1	35%
	丁基聚氧乙烯/聚丙烯嵌段共聚物	4.0%
	硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
	苯乙烯丙烯酸聚合物	1.0%
[0648]	黄原胶	0.1%
	丙二醇	5.0%
	硅酮基消泡剂	0.1%
	1,2-苯并异噻唑啉-3-酮	0.1%
	水	53.7%
[0649]	<u>实例J</u>	
[0650]	<u>在水中的乳液</u>	
	化合物 1	10.0%
	丁基聚氧乙烯/聚丙烯嵌段共聚物	4.0%
	硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
	苯乙烯丙烯酸聚合物	1.0%
	黄原胶	0.1%
[0651]	丙二醇	5.0%
	硅酮基消泡剂	0.1%
	1,2-苯并异噻唑啉-3-酮	0.1%
	芳族石油基烃	20.0
	水	58.7%
[0652]	<u>实例K</u>	
[0653]	<u>油分散体</u>	
	化合物 1	25%
[0654]	聚氧乙烯山梨醇六油酸酯	15%
	有机改性的膨润土	2.5%
[0655]	脂肪酸甲酯	57.5%
[0656]	<u>实例L</u>	
[0657]	<u>悬浮乳液</u>	

化合物 1	10.0%
吡虫啉	5.0%
丁基聚氧乙烯/聚丙烯嵌段共聚物	4.0%
硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
苯乙烯丙烯酸聚合物	1.0%
[0658] 黄原胶	0.1%
丙二醇	5.0%
硅酮基消泡剂	0.1%
1,2-苯并异噻唑啉-3-酮	0.1%
芳族石油基烃	20.0%
水	53.7%

[0659] 本披露的化合物表现出针对广谱的无脊椎有害生物的活性。这些有害生物包括栖息在各种环境中的无脊椎动物,这些环境例如像植物的叶子、根、土壤、收获的作物或其他食品、建筑结构或动物皮肤(integument)。这些有害生物包括,例如,以叶子(包括叶、茎、花和果实)、种子、木材、纺织纤维或动物血液或组织为食并因此对例如生长中或储存的农学作物、森林、温室作物、观赏植物、苗圃作物、储存食品和纤维产品、或房屋或其他结构或它们的内容物造成伤害或损害,或对动物健康或公共健康有害的无脊椎动物。本领域技术人员将理解,并不是所有的化合物对所有有害生物的所有生长阶段都是同等有效的。

[0660] 因此,这些本发明的化合物和组合物在农学上可用于保护大田作物免受植食性无脊椎有害生物的伤害,并且在非农学上也可用于保护其他园艺作物和植株免受植食性无脊椎有害生物的伤害。该效用包括保护含有通过基因工程(即转基因)引入或通过诱变改性的遗传物质的作物和其他植物(即,农学和非农学的),以提供有利性状。此类性状的实例包括对除草剂耐受、对植食性有害生物(例如,昆虫、螨虫、蚜虫、蜘蛛、线虫、蜗牛、植物病原真菌、细菌和病毒)具有抗性、植物生长得到改善、对不利生长条件(诸如高温或低温、低土壤水分或高土壤水分、和高盐度)的耐受性增加、开花或结果增加、收获产量更大、成熟更快、收获产品的质量和/或营养价值更高、或收获产品的储存或加工特性得到改善。转基因植物可被改性以表达多种性状。含有由遗传工程或诱变提供的性状的植物的实例包括表达苏云金芽孢杆菌杀昆虫毒素的玉米、棉花、大豆和马铃薯品种,诸如YIELD

GARD[®]、KNOCKOUT[®]、STARLINK[®]、BOLLGARD[®]、NuCOTN[®]和NEWLEAF[®]、INVICTA RR2PRO[™],和耐除草剂的玉米、棉花、大豆和菜籽品种,诸如ROUNDUP READY[®]、LIBERTY LINK[®]、IMI[®]、STS[®]和CLEARFIELD[®],以及表达N-乙酰转移酶(GAT)以提供对草甘膦除草剂的抗性的作物、或含有提供对抑制乙酰乳酸合成酶(ALS)的除草剂的抗性的HRA基因的作物。本发明的化合物和组合物可表现出通过遗传工程引入或通过诱变改性的性状的增强效应,从而增强性状的表型表达或有效性,或增加本发明化合物和组合物的无

脊椎有害生物防治有效性。特别地,本发明的化合物和组合物可表现出蛋白质或对无脊椎有害生物有毒的其他天然产品的表型表达的增强效应,以提供对这些有害生物的大于加性的防治。

[0661] 本披露的组合物还可任选地包含植物营养素,例如,肥料组合物,该肥料组合物包含至少一种选自氮、磷、钾、硫、钙、镁、铁、铜、硼、锰、锌和钼的植物营养素。值得注意的是包含至少一种肥料组合物的组合物,该至少一种肥料组合物包含至少一种选自氮、磷、钾、硫、钙和镁的植物营养素。进一步包含至少一种植物营养素的披露组合物可以是液体或固体的形式。值得注意的是颗粒剂、小棒或片剂形式的固体制剂。可通过将本披露的化合物或组合物与肥料组合物以及制剂成分混合,然后通过诸如造粒或挤压的方法制备制剂来制备包含肥料组合物的固体制剂。替代地,可通过将本披露的化合物或组合物在挥发性溶剂中的溶液或悬浮液喷雾在先前制备的尺寸稳定的混合物(例如,颗粒剂、小棒或片剂)形式的肥料组合物上,然后将溶剂蒸发来制备固体制剂。

[0662] 非农学用途是指在作物植株大田以外的地区的无脊椎有害生物防治。本发明的化合物和组合物的非农学用途包括在储存的谷物、豆类和其他食品以及纺织品诸如衣服和地毯中的无脊椎有害生物防治。本发明的化合物和组合物的非农学用途还包括在观赏植物、森林、庭院、路边和铁路用地以及草皮诸如草坪、高尔夫球场和牧场中的无脊椎有害生物防治。本发明的化合物和组合物的非农学用途还包括在房屋和可能被人类和/或伴侣动物、农场动物、牧场动物、动物园动物或其他动物占据的其他建筑物中的无脊椎有害生物防治。本发明的化合物和组合物的非农学用途还包括可能损害建筑物中使用的木材或其他结构材料的有害生物诸如白蚁的防治。

[0663] 本发明的化合物和组合物的非农学用途还包括通过防治寄生的或传播感染性疾病的无脊椎有害生物来保护人类和动物健康。对动物寄生虫的防治包括防治寄生在宿主动物体表(例如,肩部、腋窝、腹部、大腿内侧)的外部寄生虫和寄生在宿主动物体内(例如,胃、肠、肺、静脉、皮下、淋巴组织)的内部寄生虫。外部寄生的或传播疾病的有害生物包括,例如,恙螨(chigger)、蜱虫(tick)、虱、蚊子、蝇、螨虫和跳蚤。内部寄生虫包括心丝虫、钩虫和蠕虫。本披露的化合物和组合物适用于全身性和/或非全身性防治动物上寄生虫的侵害或感染。本披露的化合物和组合物特别适用于对抗外部寄生的或传播疾病的有害生物。本披露的化合物和组合物适用于对抗侵害以下动物的寄生虫:农业工作动物,诸如牛、羊、山羊、马、猪、驴、骆驼、水牛、兔子、母鸡、火鸡、鸭子、鹅和蜜蜂;宠物动物和家养动物,诸如狗、猫、宠物鸟和水族馆鱼类;以及所谓的实验动物,诸如仓鼠、豚鼠、大鼠和小鼠。通过对抗这些寄生虫,降低了死亡率和性能下降(在肉、奶、羊毛、毛皮、蛋、蜂蜜等方面),因此施加包含本披露的化合物的组合物允许更经济且简单的动物饲养。

[0664] 农学或非农学无脊椎有害生物的实例包括鳞翅目的卵、幼虫和成虫,诸如夜蛾科(Noctuidae)的粘虫(armyworm)、切根虫(cutworm)、尺蠖(looper)和实夜蛾亚科(heliothine)(例如,稻蛀茎夜蛾(pink stem borer)(大螟(*Sesamia inferens* Walker))、玉米钻心虫(corn stalk borer)(蛀茎夜蛾(*Sesamia nonagrioides* Lefebvre))、南方粘虫(southern armyworm)(南方灰翅夜蛾(*Spodoptera eridania* Cramer))、秋粘虫(草地贪夜蛾(*Spodoptera frugiperda* J.E.Smith))、甜菜夜蛾(beet armyworm,*Spodoptera exigua* Hübner)、棉叶虫(cotton leafworm)(海灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis*

Boisduval))、黄条粘虫(yellowstriped armyworm, *Spodoptera ornithogalli* Guenée)、小地老虎(black cutworm, *Agrotis ipsilon* Hufnagel)、藜豆夜蛾(velvetbean caterpillar, *Anticarsia gemmatalis* Hübner)、绿果夜蛾(green fruitworm) (绿果冬夜蛾(*Lithophane antennata* Walker))、甘蓝夜蛾(cabbage armyworm, *Barathra brassicae* Linnaeus)、大豆尺蠖(soybean looper) (大豆夜蛾(*Pseudoplusia includens* Walker))、粉纹夜蛾(cabbage looper, *Trichoplusia ni* Hübner)、烟青虫(tobacco budworm) (烟芽夜蛾(*Heliothis virescens* Fabricius))) ; 来自螟蛾科(Pyralidae)的螟虫(borer)、鞘蛾(casebearer)、结网虫(webworm)、球果虫(coneworm)、甘蓝虫(cabbageworm)和雕叶虫(skeletonizer) (例如, 欧洲玉米螟(European corn borer, *Ostrinia nubilalis* Hübner)、脐橙螟(navel orangeworm) (脐橙螟蛾(*Amyelois transitella* Walker))、玉米根结网虫(corn root webworm) (玉米根螟(*Crambus caliginosellus* Clemens))、草地螟(sod webworms) (螟蛾科: 草螟亚科(Crambinae)), 如草地螟(sod worm) (稻切叶野螟(*Herpetogramma licarsisalis* Walker))、甘蔗二点螟(sugarcane stem borer) (粟灰螟(*Chilo infuscatellus* Snellen))、番茄小钻蛀虫(tomato small borer, *Neoleucinodes elegantalis* Guenée)、绿卷叶螟(green leafroller) (稻纵卷叶螟(*Cnaphalocrocis medinalis*))、葡萄卷叶虫(grape leaf folder) (葡萄野螟(*Desmia funeralis* Hübner))、甜瓜野螟(melon worm) (黄瓜绢野螟(*Diaphania nitidalis* Stoll))、甘蓝芯蛴螬(cabbage center grub, *Helluala hydralis* Guenée)、三化螟(yellow stem borer, *Scirpophaga incertulas* Walker)、早期嫩梢蛀虫(early shoot borer) (蔗螟(*Scirpophaga infuscatellus* Snellen))、稻白螟(white stem borer, *Scirpophaga innotata* Walker)、顶部嫩梢蛀虫(top shoot borer) (甘蔗白螟(*Scirpophaga nivella* Fabricius))、黑头稻螟(dark-headed rice borer, *Chilo polychrysus* Meyrick)、条纹稻螟(striped riceborer) (二化螟(*Chilo suppressalis* Walker))、大菜螟(cabbage cluster caterpillar, *Crocidolomia binotalis* English)) ; 卷蛾科(Tortricidae)的卷叶虫(leafroller)、卷夜蛾(budworm)、种子蠕虫(seed worm)和果实蠕虫(fruit worm) (例如, 苹果蠹蛾(codling moth, *Cydia pomonella* Linnaeus)、葡萄卷叶蛾(grape berry moth) (葡萄果实蛀虫(*Endopiza viteana* Clemens))、梨小食心虫(oriental fruit moth, *Grapholita molesta* Busck)、苹果异形小卷蛾(citrus false codling moth, *Cryptophlebia leucotreta* Meyrick)、柑橘天牛(citrus borer, *Ecdytolopha aurantiana* Lima)、红带卷蛾(redbanded leafroller, *Argyrotaenia velutinana* Walker)、斜带卷叶蛾(obliquebanded leafroller) (蔷薇斜条卷叶蛾(*Choristoneura rosaceana* Harris))、苹果浅褐卷叶蛾(light brown apple moth, *Epiphyas postvittana* Walker)、欧洲葡萄小卷叶蛾(European grape berry moth) (女贞细卷蛾(*Eupoecilia ambiguella* Hübner))、苹果顶芽卷叶蛾(apple bud moth) (褐卷蛾(*Pandemis pyrusana* Kearfott))、杂食卷叶蛾(omnivorous leafroller, *Platynota stultana* Walsingham)、葡萄褐卷蛾(barred fruit-tree tortrix, *Pandemis cerasana* Hübner)、苹果褐卷蛾(apple brown tortrix, *Pandemis heparana* Denis&Schiffermüller)) ; 和许多其他经济上重要的鳞翅目(例如, 小菜蛾(小菜蛾(*Plutella xylostella* Linnaeus))、棉红铃虫(pink bollworm, *Pectinophora gossypiella* Saunders)、舞毒蛾(gypsy moth, *Lymantria*

dispar Linnaeus)、桃小食心虫(peach fruit borer, *Carposina niponensis* Walsingham)、桃条麦蛾(peach twig borer, *Anarsia lineatella* Zeller)、马铃薯块茎蛾(potato tuberworm, *Phthorimaea operculella* Zeller)、斑点缘虫状潜叶蛾(spotted teniform leafminer) (斑幕潜叶蛾(*Lithocolletis blancardella* Fabricius))、苹果金纹细蛾(Asiatic apple leafminer) (金纹细蛾(*Lithocolletis ringoniella* Matsumura))、稻纵卷叶螟(rice leaf folder) (美洲稻弄蝶(*Lerodea eufala* Edwards))、苹果潜叶蛾(apple leafminer) (旋纹潜叶蛾(*Leucoptera scitella* Zeller))); 蜚蠊目的卵、若虫和成虫, 包括来自姬蜚蠊科(*Blattellidae*) 和蜚蠊科(*Blattidae*) 的蟑螂(例如, 东方蟑螂(oriental cockroach) (东方蜚蠊(*Blatta orientalis* Linnaeus))、亚洲蟑螂(Asian cockroach) (亚洲蜚蠊(*Blattella asahinai* Mizukubo))、德国蟑螂(German cockroach) (德国小蠊(*Blattella germanica* Linnaeus))、棕带蟑螂(brownbanded cockroach) (长须蜚蠊(*Supella longipalpa* Fabricius))、美洲蟑螂(American cockroach) (美洲大蠊(*Periplaneta americana* Linnaeus))、褐色蟑螂(brown cockroach) (褐色大蠊(*Periplaneta brunnea* Burmeister))、马德拉蟑螂(Madeira cockroach) (马德拉蜚蠊(*Leucophaea maderae* Fabricius))、黑胸天蠊(smoky brown cockroach) (黑胸大蠊(*Periplaneta fuliginosa* Service))、澳洲蟑螂(Australian Cockroach) (澳洲大蠊(*Periplaneta australasiae* Fabr.))、龙虾蟑螂(lobster cockroach) (灰色蜚蠊(*Nauphoeta cinerea* Olivier)) 和光滑蟑螂(smooth cockroach) (淡色歪尾蠊(*Symphloe pallens* Stephens))); 鞘翅目的卵、取食叶、取食果实、取食根、取食种子和取食囊泡组织的幼虫和成虫, 包括来自长角象虫科(*Anthribidae*)、豆象科(*Bruchidae*) 和象虫科(*Curculionidae*) 的象鼻虫(weevil) (例如, 棉铃象甲(boll weevil) (墨西哥棉铃象(*Anthonomus grandis* Boheman))、稻水象甲(rice water weevil, *Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel)、谷象(granary weevil, *Sitophilus granarius* Linnaeus)、米象(rice weevil, *Sitophilus oryzae* Linnaeus)、早熟禾象鼻虫(annual bluegrass weevil, *Listronotus maculicollis* Dietz)、早熟禾谷象甲(bluegrass billbug) (牧草长喙象(*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal))、狩猎谷象(hunting billbug) (猎长喙象(*Sphenophorus venatus vestitus*))、丹佛谷象(Denver billbug) (丹佛长喙象(*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus))); 叶甲科(*Chrysomelidae*) 的跳甲(flea beetle)、黄守瓜(cucumber beetle)、根虫(rootworm)、叶甲(leaf beetle)、马铃薯甲虫(potato beetle) 和潜叶虫(leafminer) (例如, 科罗拉多马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata* Say)、西方玉米根虫(*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); 来自金龟子科(*Scarabaeidae*) 的金龟子和其他甲虫(例如, 日本丽金龟(Japanese beetle, *Popillia japonica* Newman)、东方丽金龟(oriental beetle, *Anomala orientalis* Waterhouse, *Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud)、北方独角仙(northern masked chafer) (北方圆头犀金龟(*Cyclocephala borealis* Arrow))、南方独角仙(southern masked chafer) (南方圆头犀金龟(*Cyclocephala immaculata* Olivier 或 *C. lurida* Bland))、蜣螂(dung beetle) 和蛴螬(white grub) (蜣金龟属(*Aphodius*) 物种)、黑色草坪草金龟(black turfgrass atenius) (黑绒金龟(*Ataenius spretulus* Haldeman))、绿色六月金龟(green June beetle) (绿花金龟(*Cotinis nitida* Linnaeus))、亚洲花园甲虫

(Asiatic garden beetle) (栗色绒金龟 (*Maladera castanea* Arrow))、五月/六月鳃角金龟 (May/June beetles) (六月鳃角金龟属 (*Phyllophaga*) 物种) 和欧洲金龟子 (European chafer) (欧洲鳃角金龟 (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky))；来自皮蠹科 (*Dermestidae*) 的红缘皮蠹 (carpet beetle)；来自叩甲科 (*Elateridae*) 的金针虫 (wireworm)；来自棘胫小蠹科 (*Scolytidae*) 的小蠹 (bark beetle) 和来自拟步甲科 (*Tenebrionidae*) 的面粉甲虫 (flour beetle)。

[0665] 另外,农学和非农学有害生物包括:革翅目的卵、成虫和幼虫,包括来自球螋科 (*Forficulidae*) 的螋螋 (earwig) (例如,欧洲螋螋 (European earwig) (地蜈蚣 (*Forficula auricularia* Linnaeus))、黑螋螋 (black earwig, *Chelisoches morio* Fabricius))；半翅目 (*Hemiptera*) 的卵、幼虫、成虫和若虫,诸如来自盲蝽科 (*Miridae*) 的盲蝽 (plant bug)、来自蝉科 (*Cicadidae*) 的蝉 (cicada)、来自大叶蝉科 (*Cicadellidae*) 的叶蝉 (leafhopper) (例如,小绿叶蝉属 (*Empoasca*) 物种)、来自臭虫科 (*Cimicidae*) 的臭虫 (bed bug) (例如,温带臭虫 (*Cimex lectularius* Linnaeus))、来自蜡蝉科 (*Fulgoridae*) 和飞虱科 (*Delphacidae*) 的飞虱 (planthopper)、来自角蝉科 (*Membracidae*) 的角蝉 (treehopper)、来自扁木虱科 (*Liviidae*)、木虱科 (*Psyllidae*) 和个木虱科 (*Triozidae*) 的木虱 (psyllid)、来自粉虱科 (*Aleyrodidae*) 的粉虱 (whiteflies)、来自蚜科 (*Aphididae*) 的蚜虫、来自根瘤蚜科 (*Phylloxera*) 的根瘤蚜 (phylloxera)、来自粉蚧科 (*Pseudococcidae*) 的粉蚧 (mealybug)、来自蚧科 (*Coccidae*)、盾蚧科 (*Diaspididae*) 和绵蚧科 (*Margarodidae*) 的介壳虫 (scale)、来自网蝽科 (*Tingidae*) 的网蝽 (lace bug)、来自蝽科 (*Pentatomidae*) 的蝽象 (stink bug)、来自长蝽科 (*Lygaeidae*) 的长蝽 (chinch bug) (例如,毛长蝽 (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon) 和南部长蝽 (*Blissus insularis* Barber)) 和其他来自长蝽科的籽长蝽 (seed bug)、来自沫蝉科 (*Cercopidae*) 的沫蝉 (spittlebug)、来自缘蝽科 (*Coreidae*) 的缘蝽 (squash bug) 以及来自红蝽科 (*Pyrrhocoridae*) 的红蝽 (red bug) 和棉红蝽 (cotton stainer)。

[0666] 农学和非农学有害生物还包括:蜱螨目 (*Acari*) (螨虫) 的卵、幼虫、若虫和成虫,如叶螨科 (*Tetranychidae*) 的叶螨 (spider mite) 和红螨 (red mite) (例如,欧洲红螨 (*Panonychus ulmi* Koch)、二斑叶螨 (*Tetranychus urticae* Koch)、迈叶螨 (*Tetranychus mcdanieli* McGregor))；细须螨科 (*Tenuipalpidae*) 的短须螨 (flat mite) (例如,葡萄短须螨 (citrus flat mite) (刘氏短须螨 (*Brevipalpus lewisi* McGregor)))；瘿螨科 (*Eriophyidae*) 的锈螨 (rust mite) 和芽螨 (bud mite) 以及其他取食叶的螨虫和在人类和动物健康方面重要的螨虫,即表皮螨科 (*Epidermoptidae*) 的尘螨、蠕形螨科 (*Demodicidae*) 的毛囊螨、甘螨科 (*Glycyphagidae*) 的谷螨；(硬蜱科) 的蜱虫,通常称为硬蜱 (例如,鹿蜱 (deer tick) (黑脚硬蜱 (*Ixodes scapularis* Say))、澳大利亚麻痹蜱 (Australian paralysis tick) (全环硬蜱 (*Ixodes holocyclus* Neumann))、美洲犬蜱 (American dog tick) (变异革蜱 (*Dermacentor variabilis* Say))、孤星蜱 (lone star tick) (美洲钝眼蜱 (*Amblyomma americanum* Linnaeus))) 和软蜱科 (*Argasidae*) 的蜱虫,通常称为软蜱 (例如,回归热蜱 (relapsing fever tick) (回归热钝缘蜱 (*Ornithodoros turicata*))、常见鸡蜱 (common fowl tick, *Argas radiatus*))；痒螨科 (*Psoroptidae*)、蒲螨科 (*Pyemotidae*) 和疥螨科 (*Sarcoptidae*) 的疥螨 (scab mite) 和痒螨 (itch mite)；直翅目的卵、成虫和幼虫,包

括蚱蜢、蝗虫和蟋蟀(例如,迁徙蚱蜢(migratory grasshoppers)(例如,血黑蝗(Melanoplus sanguinipes Fabricius)、殊种蝗(M.differentialis Thomas))、美洲蚱蜢(American grasshoppers)(例如美洲沙漠蝗(Schistocerca americana Drury))、沙漠蝗(desert locust, Schistocerca gregaria Forskal)、飞蝗(migratory locust, Locusta migratoria Linnaeus)、灌木蝗(bush locust)(腺蝗属(Zonocerus)物种)、家蟋蟀(house cricket, Acheta domesticus Linnaeus)、蝼蛄(mole crickets)(例如,黄褐色蝼蛄(tawny mole cricket, Scapteriscus vicinus Scudder)和南美蝼蛄(southern mole cricket, Scapteriscus borellii Giglio-Tos));双翅目的卵、成虫和幼虫,包括潜叶虫(例如,斑潜蝇属(Liriomyza)物种,如蔬菜斑潜蝇(serpentine vegetable leafminer)(美洲斑潜蝇(Liriomyza sativae Blanchard)))、蠓(midges)、果蝇(fruit flies)(实蝇科(Tephritidae))、麦秆蝇(frit flies)(例如,瑞典麦秆蝇(Oscinella frit Linnaeus))、土壤蛆(soil maggots)、家蝇(house flies)(例如,家蝇(Musca domestica Linnaeus))、小家蝇(lesser house flies)(例如,夏厕蝇(Fannia canicularis Linnaeus)、小舍蝇(F.femoralis Stein))、厩螫蝇(stable flies)(例如,厩螫蝇(Stomoxys calcitrans Linnaeus))、秋家蝇(face flies)、角蝇(horn flies)、丽蝇(blow flies)(例如,金蝇属(Chrysomya)物种、伏蝇属(Phormia)物种)以及其他蝇类(muscoid fly)有害生物、马蝇(horse flies)(例如,虻属(Tabanus)物种)、肤蝇(bot flies)(例如,胃蝇属(Gastrophilus)物种、狂蝇属(Oestrus)物种)、纹皮蝇(cattle grubs)(例如,牛皮蝇属(Hypoderma)物种)、鹿虻(deer flies)(例如,斑虻属(Chrysops)物种)、羊蜱蝇(keds)(例如,绵羊虱蝇(Melophagus ovinus Linnaeus))以及其他短角亚目(Brachycera)、蚊子(例如,伊蚊属(Aedes)物种、按蚊属(Anopheles)物种、库蚊属(Culex)物种)、蚋(black flies)(例如,原蚋属(Prosimulium)物种、蚋属(Simulium)物种)、叮咬蠓(biting midges)、沙蝇(sand flies)、眼菌蚊(sciarids)和其他长角亚目(Nematocera);缨翅目的卵、成虫、和幼虫,包括洋葱蓟马(onion thrips)(烟蓟马(Thrips tabaci Lindeman))、花蓟马(flower thrips)(花蓟马属(Frankliniella)物种)以及其他取食叶子的蓟马;膜翅目的昆虫有害生物,包括蚁科(Formicidae)的蚂蚁,包括佛罗里达木蚁(Florida carpenter ant)(佛罗里达弓背蚁(Camponotus floridanus Buckley))、红木蚁(red carpenter ant, Camponotus ferrugineus Fabricius)、黑木蚁(black carpenter ant, Camponotus pennsylvanicus DeGeer)、白足蚁(white-footed ant, Technomyrmex albipes fr. Smith)、大头蚁(big headed ants)(大头蚁属(Pheidole)物种)、幽灵蚁(ghost ant)(黑头酸臭蚁(Tapinoma melanocephalum Fabricius));法老蚁(Pharaoh ant)(小黄家蚁(Monomorium pharaonis Linnaeus))、小火蚁(little fire ant, Wasmannia auropunctata Roger)、火蚁(fire ant, Solenopsis geminata Fabricius)、红火蚁(red imported fire ant, Solenopsis invicta Buren)、阿根廷蚁(Argentine ant, Iridomyrmex humilis Mayr)、疯蚁(crazy ant)(长角立毛蚁(Paratrechina longicornis Latreille))、铺道蚁(pavement ant)(草地铺道蚁(Tetramorium caespitum Linnaeus))、玉米田蚁(cornfield ant, Lasius alienus Förster)和香家蚁(odorous house ant)(家蚁(Tapinoma sessile Say))。其他膜翅目,包括蜂(包括木蜂(car Carpenter bees))、大黄蜂(hornets)、小黄蜂(yellow jackets)、胡蜂(wasps)和叶蜂(sawflies)(新松叶蜂属(Neodiprion)物种;茎蜂属(Cephus)物种);等

翅目 (Isoptera) 的昆虫有害生物, 包括白蚁科 (Termitidae) (例如, 大白蚁属 (Macrotermes) 物种、土白蚁 (*Odontotermes obesus* Rambur))、木白蚁科 (Kalotermitidae) (例如, 堆砂白蚁属 (*Cryptotermes*) 物种)、以及鼻白蚁科 (Rhinotermitidae) (例如, 散白蚁属 (*Reticulitermes*) 物种、乳白蚁属 (*Coptotermes*) 物种、鼻异白蚁 (*Heterotermes tenuis* Hagen)) 的白蚁, 东部地下白蚁 (*Reticulitermes flavipes* Kollar)、西部地下白蚁 (*Reticulitermes hesperus* Bank)、台湾乳白蚁 (*Coptotermes formosanus* Shiraki)、西印度干木白蚁 (*Incisitermes immigrans* Snyder)、粉白蚁 (*Cryptotermes brevis* Walker)、干木白蚁 (*Incisitermes snyderi* Light)、东南部地下白蚁 (*Reticulitermes virginicus* Banks)、西部干木白蚁 (*Incisitermes minor* Hagen)、树栖白蚁 (arboreal termites) 诸如象白蚁属 (*Nasutitermes*) 物种, 以及其他具有经济重要性的白蚁; 缨尾目的昆虫有害生物, 诸如蠹虫 (silverfish) (衣鱼 (*Lepisma saccharina* Linnaeus)) 和家衣鱼 (firebrat) (家衣鱼 (*Thermobia domestica* Packard)); 食毛目的昆虫有害生物, 包括头虱 (head louse, *Pediculus humanus capitis* De Geer)、体虱 (body louse, *Pediculus humanus* Linnaeus)、鸡体虱 (chicken body louse, *Menacanthus stramineus* Nitsch)、狗啮毛虱 (dog biting louse) (犬毛虱 (*Trichodectes canis* De Geer))、绒毛虱 (fluff louse, *Goniocotes gallinae* De Geer)、羊体虱 (sheep body louse) (羊虱 (*Bovicola ovis* Schrank))、短鼻牛虱 (short-nosed cattle louse) (牛血虱 (*Haematopinus eurysternus* Nitsch))、长鼻牛虱 (long-nosed cattle louse) (牛颞虱 (*Linognathus vituli* Linnaeus)) 以及其他攻击人和动物的吸吮和嚼咬型寄生虱; 蚤目 (Siphonoptera) 的昆虫有害生物, 包括东方鼠蚤 (the oriental rat flea) (印鼠客蚤 (*Xenopsylla cheopis* Rothschild))、猫蚤 (cat flea) (猫栳头蚤 (*Ctenocephalides felis* Bouche))、犬蚤 (dog flea) (犬栳首蚤 (*Ctenocephalides canis* Curtis))、鸡蚤 (hen flea) (鸡角叶蚤 (*Ceratophyllus gallinae* Schrank))、吸着蚤 (sticktight flea) (禽角头蚤 (*Echidnophaga gallinacea* Westwood))、人蚤 (human flea, *Pulex irritans* Linnaeus) 以及其他折磨哺乳动物和禽类的跳蚤。所覆盖的另外节肢动物有害生物包括: 蜘蛛目的蜘蛛, 诸如棕色遁蛛 (the brown recluse spider) (棕隐士蛛 (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik)) 和黑寡妇毒蛛 (the black widow spider, *Latrodectus mactans* Fabricius), 以及蚰蜒目的蜈蚣, 诸如蚰蜒 (the house centipede, *Scutigera coleoptrata* Linnaeus)。

[0667] 存储谷物中的无脊椎有害生物的实例包括平截长蠹 (larger grain borer) (大谷蠹 (*Prostephanus truncatus*))、谷蠹 (lesser grain borer, *Rhyzopertha dominica*)、米象 (rice weevil, *Stiophilus oryzae*)、玉米象 (maize weevil, *Stiophilus zeamais*)、豆象 (cowpea weevil) (四纹豆象 (*Callosobruchus maculatus*))、赤拟谷盗 (red flour beetle, *Tribolium castaneum*)、谷象 (granary weevil, *Stiophilus granarius*)、印度谷螟 (Indian meal moth, *Plodia interpunctella*)、地中海面粉甲虫 (Mediterranean flour beetle) (地中海粉螟 (*Ephestia kuhniella*)) 和长角扁谷盗或锈扁谷盗 (flat or rusty grain beetle) (锈赤扁谷盗 (*Cryptolestis ferrugineus*))。

[0668] 本披露的化合物可以具有针对线虫纲 (Nematoda)、绦虫纲 (Cestoda)、吸虫纲和棘

头纲(Acanthocephala)的成员的活性,包括经济上重要的圆线虫目(Strongylida)、蛔目(Ascaridida)、尖尾目(Oxyurida)、小杆目(Rhabditida)、旋尾目(Spirurida)和嘴刺目(Enoplida)的成员,诸如但不限于经济上重要的农业有害生物(即,根结线虫属(Meloidogyne)中的根结线虫、短体线虫属(Pratylenchus)中的根腐线虫(lesion nematodes)、毛刺线虫属(Trichodorus)中的粗短根线虫(stubby root nematodes)等)以及动物和人类健康有害生物(即,所有经济上重要的吸虫、绦虫和蛔虫,诸如马中的寻常圆线虫(*Strongylus vulgaris*)、犬中的犬弓蛔虫(*Toxocara canis*)、羊中的捻转血矛线虫(*Haemonchus contortus*)、犬中的犬恶丝虫(*Dirofilaria immitis* Leidy)、马中的叶状裸头绦虫(*Anoplocephala perfoliata*)、反刍动物中的肝片吸虫(*Fasciola hepatica* Linnaeus)等)。

[0669] 本披露的化合物显示出针对鳞翅目中的有害生物的特殊高的活性(例如,棉叶波纹夜蛾(*Alabama argillacea* Hübner)(棉叶虫)、果树黄卷蛾(*Archips argyrospila* Walker)(果树卷叶蛾)、*A. rosana* Linnaeus(欧洲卷叶蛾)以及其他黄卷蛾属(*Archips*)物种、二化螟(*Chilo suppressalis* Walker)(稻螟)、稻纵卷叶螟(*Cnaphalocrosis medinalis* Guenée, rice leaf roller)、玉米根草螟(*Crambus caliginosellus* Clemens)(玉米根结网虫)、早熟禾草螟(*Crambus teterrellus* Zincken, bluegrass webworm)、苹果蠹蛾(*Cydia pomonella* Linnaeus, codling moth)、棉斑实蛾(*Earias insulana* Boisduval)(多刺螟蛉虫)、翠纹钻夜蛾(*Earias vittella* Fabricius)(斑点螟蛉虫)、棉铃虫(*Helicoverpa armigera* Hübner)(美洲棉铃虫)、谷实夜蛾(*Helicoverpa zea* Boddie)(玉米穗虫)、烟芽夜蛾(*Heliothis virescens* Fabricius)(烟青虫)、草地螟(*Herpetogramma licarsisalis* Walker, sod webworm)、葡萄花翅小卷蛾(*Lobesia botrana* Denis&Schiffermüller)(葡萄卷叶蛾)、棉红铃虫(*Pectinophora gossypiella* Saunders, pink bollworm)、柑橘潜叶蛾(*Phyllocnistis citrella* Stainton, citrus leafminer)、大菜粉蝶(*Pieris brassicae* Linnaeus)(大白粉蝶)、小菜粉蝶(*Pieris rapae* Linnaeus)(小白粉蝶)、小菜蛾(*Plutella xylostella* Linnaeus, diamondback moth)、甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua* Hübner, beet armyworm)、斜纹夜蛾(*Spodoptera litura* Fabricius, tobacco cutworm, cluster caterpillar)、草地贪夜蛾(*Spodoptera frugiperda* J.E. Smith)(秋夜蛾)、粉纹夜蛾(*Trichoplusia ni* Hübner, cabbage looper)和番茄潜叶蛾(*Tuta absoluta* Meyrick, tomato leafminer)。

[0670] 本披露的化合物还可对来自半翅目的成员具有显著的活性,这些成员包括:豌豆蚜(*Acyrtosiphon pisum* Harris)、豇豆蚜(*Aphis craccivora* Koch)、蚕豆蚜(*Aphis fabae* Scopoli)、棉蚜(*Aphis gossypii* Glover)、苹果蚜(*Aphis pomi* De Geer)、绣线菊蚜(*Aphis spiraeicola* Patch)、毛地黄蚜(*Aulacorthum solani* Kaltenbach)、草莓蚜(*Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell)、俄罗斯小麦蚜(*Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko)、车前圆尾蚜(*Dysaphis plantaginea* Passerini)、苹果绵蚜(*Eriosoma lanigerum* Hausmann)、桃大尾蚜(*Hyalopterus pruni* Geoffroy)、萝卜蚜(*Lipaphis pseudobrassicae* Davis)、麦蚜(*Metopolophium dirhodum* Walker)、马铃薯蚜(*Macrosiphum euphorbiae* Thomas)、桃蚜(*Myzus persicae* Sulzer)、莨苳蚜(*Nasonovia ribisnigri* Mosley)、瘿绵蚜属(*Pemphigus*)物种(根蚜(root aphids)和倍蚜(gall

aphids))、玉米蚜(*Rhopalosiphum maidis* Fitch)、禾谷缢管蚜(*Rhopalosiphum padi* Linnaeus)、麦二叉蚜(*Schizaphis graminum* Rondani)、麦长管蚜(*Sitobion avenae* Fabricius)、苜蓿斑蚜(*Therioaphis maculata* Buckton)、橘二叉蚜(*Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe)和褐色橘蚜(*Toxoptera citricidus* Kirkaldy);球属(*Adelges*)物种(球蚜(adelgids));长山核桃根瘤蚜(*Phylloxera devastatrix* Pergande)(山胡桃根瘤蚜(pecan phylloxera));烟粉虱(*Bemisia tabaci* Gennadius)(烟粉虱(tobacco whitefly),甘薯粉虱(sweetpotato whitefly))、银叶粉虱(*Bemisia argentifolii* Bellows&Perring)(银叶粉虱)、柑橘粉虱(*Dialeurodes citri* Ashmead,citrus whitefly)和温室粉虱(*Trialeurodes vaporariorum* Westwood,greenhouse whitefly);马铃薯叶蝉(*Empoasca fabae* Harris)、小褐飞虱(*Laodelphax striatellus* Fallen)、二点叶蝉(*Macrostelus quadrilineatus* Forbes)、稻黑尾叶蝉(*Nephotettix cincticeps* Uhler)、黑尾叶蝉(*Nephotettix nigropictus* Stål)、褐飞虱(*Nilaparvata lugens* Stål)、玉米飞虱(*Peregrinus maidis* Ashmead)、白背飞虱(*Sogatella furcifera* Horvath)、稻飞虱(*Tagosodes orizicolus* Muir)、苹果白叶蝉(*Typhlocyba pomaria* McAtee)、葡萄斑叶蝉属(*Erythroneura*)物种(葡萄叶蝉(grape leafhoppers));十七年蝉(*Magicidada septendecim* Linnaeus)(周期蝉(periodical cicada));吹绵蚧(*Icerya purchasi* Maskell,cottony cushion scale)、梨圆蚧(*Quadraspidiotus perniciosus* Comstock, San Jose scale);臀纹粉蚧(*Planococcus citri* Risso)(桔粉蚧(citrus mealybug));粉蚧属(*Pseudococcus*)物种(其他粉蚧系群);梨木虱(*Cacopsylla pyricola* Foerster,pear psylla)、柿木虱(*Trioza diospyri* Ashmead,persimmon psylla)。

[0671] 本披露的化合物还对来自半翅目的成员具有活性,这些成员包括:稻绿蝽(*Acrosternum hilare* Say)、南瓜缘蝽(*Anasa tristis* De Geer)、麦长蝽(*Blissus leucopterus leucopterus* Say)、温带臭虫(*Cimex lectularius* Linnaeus)、棉网蝽(*Corythuca gossypii* Fabricius)、番茄蝽(*Cyrtopeltis modesta* Distant)、棉红蝽(*Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer)、褐臭蝽(*Euchistus servus* Say)、单斑蝽(*Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois)、Graptosthetus属物种(长蝽系群)、茶翅蝽(*Halymorpha halys* Stål)、松叶根蝽(*Leptoglossus corculus* Say)、美国牧草盲蝽(*Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois)、南方绿蝽(*Nezara viridula* Linnaeus)、稻褐蝽(*Oebalus pugnax* Fabricius)、大马利筋长蝽(*Oncopeltus fasciatus* Dallas)、棉盲蝽(*Pseudatomoscelis seriatus* Reuter)。由本披露的化合物防治的其他昆虫目包括缨翅目(例如,西花蓟马(*Frankliniella occidentalis* Pergande,western flower thrips)、桔实蓟马(*Scirtothrips citri* Moulton)(柑橘蓟马(citrus thrips))、大豆蓟马(*Sericothrips variabilis* Beach,soybean thrips)和烟蓟马(洋葱蓟马));以及鞘翅目(例如,马铃薯叶甲(科罗拉多马铃薯甲虫)、墨西哥豆瓢虫(*Epilachna varivestis* Mulsant,Mexican bean beetle)以及叩甲属(*Agriotes*)、Athous属或丘胸叩甲属(*Limonius*)的金针虫)。

[0672] 值得注意的是本披露的化合物用于防治西花蓟马的用途。值得注意的是本披露的化合物用于防治小菜蛾(*Plutella xylostella*)的用途。值得注意的是本披露的化合物用于防治秋粘虫(草地贪夜蛾)的用途。

[0673] 本披露的化合物还可用于增加作物植株的活力。该方法包括使作物植株(例如,叶子、花、果实或根)或生长出作物植株的种子与足以实现期望的植株活力效果的量(即生物学有效量)式1的化合物接触。典型地,式1的化合物以配制的组合物施用。尽管式1的化合物通常直接施用于作物植株或其种子,但这些化合物也可施用于作物植株的所在地,即作物植株的环境,特别是足够接近以允许式1的化合物迁移到作物植株的环境部分。与该方法相关的所在地最通常包括生长介质(即为植株提供营养素的介质),典型地是其中生长植株的土壤。因此,为了增加作物植株的活力对作物植株的处理包括使作物植株、生长出作物植株的种子或作物植株的所在地与生物学有效量的式1的化合物接触。

[0674] 增加作物活力可导致以下观察到的效果中的一项或多项:(a)如通过优异的种子发芽、作物出苗和作物密度(stand)展示的最佳作物栽培(establishment);(b)如通过快速且健壮的叶生长(例如,通过叶面积指数测量)、植株高度、分蘖数(例如,对于稻)、根群和作物的营养体的总干重展示的增强的作物生长;(c)如通过开花时间、开花持续时间、花的数目、总生物量积聚(即产量)和/或果实或谷物的产品等级可销售性(即产质量)展示的改善的作物产量;(d)增强的作物耐受或预防植物病害感染和节肢动物、线虫或软体动物有害生物侵害的能力;以及(e)增加的作物耐受环境胁迫(诸如暴露于极端热量、次最佳水分或植物性毒素化学品)的能力。

[0675] 与未经处理的植株相比,本披露的化合物可通过杀死植食性无脊椎有害生物或以其他方式防止植食性无脊椎有害生物在植株环境中的取食来增加经处理的植株的活力。在不存在植食性无脊椎有害生物的此类防治的情况下,有害生物通过消耗植物组织或汁液,或传播植物病原体诸如病毒来降低植株活力。甚至在不存在植食性无脊椎有害生物的情况下,本披露的化合物可通过改变植物的代谢来增加植物活力。通常,如果植株生长在非理想的环境中,即包含一个或多个不利于植株实现其在理想环境中应表现出的完全遗传潜力的方面的环境,那么作物植株的活力将通过用本披露的化合物处理该植株最显著地增加。

[0676] 值得注意的是用于增加作物植株活力的本发明的方法,其中该作物植株在包括植食性无脊椎有害生物的环境中生长。还值得注意的是用于增加作物植株活力的本发明的方法,其中该作物植株在不包括植食性无脊椎有害生物的环境中生长。还值得注意的是用于增加作物植株活力的本发明的方法,其中该作物植株在包括少于支持作物植株生长的理想水分量的水分量的环境中生长。值得注意的是用于增加作物植株活力的本发明的方法,其中该作物是稻。还值得注意的是用于增加作物植株活力的本发明的方法,其中该作物是玉蜀黍(玉米)。还值得注意的是用于增加作物植株活力的本发明的方法,其中该作物是大豆。

[0677] 本披露的化合物还可与一种或多种其他生物学活性化合物或剂混合以形成多组分杀有害生物剂,从而赋予甚至更广谱的农学和非农学效用,这些生物学活性化合物或剂包括杀昆虫剂、杀真菌剂、杀线虫剂、杀菌剂、杀螨剂、除草剂、除草剂安全剂、生长调节剂诸如昆虫蜕皮抑制剂和生根刺激剂、化学不育剂、化学信息素、驱虫剂、引诱剂、信息素、取食刺激剂、其他生物学活性化合物或昆虫病原细菌、病毒或真菌。因此,本披露还涉及包含生物学有效量的式1的化合物、至少一种附加组分和至少一种附加生物学活性化合物或药剂的组合物,该至少一种附加组分选自由表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂组成的组。对于本披露的混合物,可将其他生物学活性化合物或剂与本发明化合物(包括式1的化合物)一起配制以形成预混物,或者其他生物学活性化合物或剂可与本发明化合物(包括式1的化

合物)分开配制,并且在施加前将这两种制剂组合在一起(例如,在喷雾槽中),或可替代地,将这两种制剂依次施加。

[0678] 可与本披露的化合物一起配制的此类生物学活性化合物或药剂的实例是杀昆虫剂,诸如阿巴汀、乙酰甲胺磷、灭螨醌、啉虫脒、氟丙菊酯、阿克那比(acynonapyr)、双丙环虫酯([(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS) -3-[(环丙基羰基)氧基]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氢-6,12-二羟基-4,6a,12b-三甲基-11-氧代-9-(3-吡啶基)-2H,11H-萘并[2,1-b]吡喃并[3,4-e]吡喃-4-基]甲基环丙烷甲酸酯)、磺胺螨酯、双甲脒、阿维菌素、印楝素、保棉磷、丙硫克百威、杀虫磺、苯吡氧嘧啶(benzpyrimoxan)、联苯菊酯、 κ -联苯菊酯、联苯肼酯、双三氟虫脒、硼酸盐、溴虫氟苯双酰胺(broflanilide)、噻嗪酮、硫线磷、甲萘威、克百威、杀螟丹、伐虫脒、氯虫苯甲酰胺、溴虫腈、氟啉脒、氯丙炔菊酯(chloroprallethrin)、毒死蜱、毒死蜱-e(chlorpyrifos-e)、甲基毒死蜱、环虫酰胺、四螨嗪、右旋反式氯丙炔菊酯(chloroprallethrin)、噻虫胺、溴氰虫酰胺(3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[4-氰基-2-甲基-6-[(甲基氨基)羰基]苯基]-1H-吡啶-5-甲酰胺)、环溴虫酰胺(3-溴-N-[2-溴-4-氯-6-[[(1-环丙基乙基)氨基]羰基]苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡啶-5-甲酰胺)、乙氰菊酯、环氧虫啉((5S,8R)-1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2,3,5,6,7,8-六氢-9-硝基-5,8-环氧基-1H-咪唑并[1,2-a]氮杂卓)、腈吡螨酯、丁氟螨酯、氟氯氰菊酯、高效氟氯氰菊、氯氟氰虫酰胺、三氟氯氰菊酯、精高效氯氟氰菊酯、高效氯氟氰菊酯、氯氟菊酯、顺式氯氟菊酯、 ζ -氯氟菊酯、灭蝇胺、溴氰菊酯、丁醚脒、二嗪磷、敌克美施(dicloromesotiaz)、狄氏剂、除虫脒、四氟甲醚菊酯、杀虫双、乐果、噻虫啉酰胺、呋虫胺、苯虫醚、甲氨基阿维菌素、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐、硫丹、高氰戊菊酯、乙虫腈、醚菊酯、 ϵ -甲氧苄氟菊酯、乙螨唑、苯丁锡、杀螟硫磷、苯硫威、苯氧威、甲氰菊酯、氰戊菊酯、氟虫腈、氟麦托醌(2-乙基-3,7-二甲基-6-[4-(三氟甲氧基)苯氧基]-4-喹啉基甲基碳酸酯)、氟啉虫酰胺、三氟咪啉酰胺、氟虫双酰胺、氟氰戊菊酯、噻虫胺、氟虫脒、氟菌螨酯(α E)-2-[[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]甲基]- α -(甲氧基亚甲基)苯乙酸甲酯)、氟速芬(5-氯-2-[(3,4,4-三氟-3-丁烯-1-基)磺酰基]噻唑)、氟己芬、氟吡菌酰胺、丁虫腈(flupiprole)(1-[2,6-二氯-4-(三氟甲基)苯基]-5-[(2-甲基-2-丙烯-1-基)氨基]-4-[(三氟甲基)亚磺酰基]-1H-吡啶-3-甲腈)、氟吡呋喃酮(4-[[(6-氯-3-吡啶基)甲基](2,2-二氟乙基)氨基]-2(5H)-呋喃酮)、氟必灵(flupyrimin)、氟胺氰菊酯、氟胺氰戊菊酯、氟噁唑酰胺、地虫硫磷、伐虫脒、噻嗪膦、精高效氯氟氰菊酯、氯虫酰胺、七氟甲醚菊酯([2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苯基]甲基2,2-二甲基-3-[(1Z)-3,3,3-三氟-1-丙烯-1-基]环丙烷羧酸酯)、氟铃脒、噻嗪酮、氟蚁脞、吡虫啉、茚虫威、杀虫肥皂、异丙胺磷、异噁唑虫酰胺、 κ -七氟菊酯、高效氯氟氰菊酯、虱螨脒、马拉硫磷、氯氟醚菊酯([2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苯基]甲基(1R,3S)-3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基环丙烷羧酸酯)、氟氟虫脞、四聚乙醛、甲胺磷、杀扑磷、甲硫威、灭多威、烯虫酯、甲氧滴滴涕、甲氧苄氟菊酯、甲氧虫酰胺、 ϵ -甲氧苄氟菊酯、 ϵ -氟氯氰菊酯(momfluorothrin)、久效磷、单氟菊酯([2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苯基]甲基3-(2-氰基-1-丙烯-1-基)-2,2-二甲基环丙烷羧酸酯)、烟碱、烯啉虫胺、硝虫噻嗪、氟酰胺、多氟脒、杀线威、苯并噁唑(oxazosulfonyl)、对硫磷、甲基对硫磷、氯菊酯、甲拌磷、伏杀硫磷、亚胺硫磷、磷胺、抗蚜威、丙溴磷、丙氟菊酯、炔螨特、丙苯炔菊酯、吡氟丁酰胺(1,3,5-三甲基-N-(2-甲基-1-氧丙基)-N-[3-(2-甲基丙基)-4-[2,2,2-三氟-1-甲氧基-1-(三氟甲基)乙基]苯基]-1H-吡啶-4-甲酰胺)、吡蚜酮、啉

吡唑虫胺、除虫菊素、哒螨灵、啉虫丙醚、吡氟啉虫啉、嘧螨胺((α E)-2-[[[2-[(2,4-二氯苯基)氨基]-6-(三氟甲基)-4-噻啉基]氧基]甲基]- α -(甲氧基亚甲基)苯乙酸甲酯)、吡唑虫啉、吡丙醚、鱼藤酮、兰尼碱、氟硅菊酯、乙基多杀菌素、多杀菌素、螺螨酯、螺甲螨酯、甲氧哌啉乙酯(spiropidion)、螺虫乙酯、硫丙磷、氟啉虫胺脒(N-[甲基氧化物[1-[6-(三氟甲基)-3-吡啉基]乙基]- λ^4 -亚磺胺基]氰胺)、虫酰肼、吡螨胺、氟苯脲、七氟菊酯、 κ -七氟菊酯、特丁硫磷、四氯虫酰胺、杀虫畏、胺菊酯、四氟醚菊酯([2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基甲基)苯基]甲基2,2,3,3-四甲基环丙烷羧酸酯)、四唑虫酰胺、噻虫啉、噻虫嗪、硫双威、杀虫双、噻啉沙芬(3-苯基-5-(2-噻吩基)-1,2,4-噁二唑)、唑虫酰胺、四溴菊酯、啉蚜威、敌百虫、三氟苯嘧啉(2,4-二氧化-1-(5-噻啉基甲基)-3-[3-(三氟甲基)苯基]-2H-吡啉并[1,2-a]噻啉内盐)、杀铃脲、替环吡啉弗(tyclopyrazoflor)、高效氯氟菊酯、苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素、昆虫病原细菌、昆虫病原病毒或昆虫病原真菌。

[0679] 值得注意的是杀昆虫剂,诸如阿巴汀、啉虫脒、氟丙菊酯、阿克那比、双丙环虫酯、双甲脒、阿维菌素、印楝素、丙硫克百威、杀虫磺、联苯菊酯、噻嗪酮、溴虫氟苯双酰胺、硫线磷、甲萘威、杀螟丹、氯虫苯甲酰胺、右旋反式氯丙炔菊酯、溴虫脒、毒死蜱、噻虫胺、溴氟虫酰胺、环溴虫酰胺、乙氰菊酯、氟氯氟菊酯、高效氟氯氟菊、三氟氯氟菊酯、精高效氯氟氟菊酯、高效氯氟氟菊酯、氯氟菊酯、顺式氯氟菊酯、 ζ -氯氟菊酯、灭蝇胺、溴氟菊酯、狄氏剂、呋虫胺、苯虫醚、甲氨基阿维菌素、硫丹、 ϵ -甲氧苄氟菊酯、高氟戊菊酯、乙虫脒、醚菊酯、乙螨啉、杀螟硫磷、苯硫威、苯氧威、氰戊菊酯、氟虫脒、氟麦托醌、氟噁啉酰胺、氟虫双酰胺、氟噻虫砒、氟虫脲、氟菌螨酯、联氟砒、丁虫脒、氟必灵、氟吡呋喃酮、氟胺氟菊酯、伐虫脒、噻啉膦、精高效氯氟氟菊酯、七氟甲醚菊酯、氟铃脲、氟蚁脲、吡虫啉、茚虫威、异噁啉虫酰胺、 κ -七氟菊酯、高效氯氟氟菊酯、虱螨脲、氯氟醚菊酯、氟氟虫脲、甲硫威(methiodicarb)、灭多威、烯虫酯、甲氧虫酰肼、甲氧苄氟菊酯、单氟菊酯、烯啉虫胺、硝虫噻嗪、氟酰胺、杀线威、吡氟丁酰胺、吡蚜酮、除虫菊素、哒螨灵、啉虫丙醚、嘧螨胺、吡丙醚、兰尼碱、乙基多杀菌素、多杀菌素、螺螨酯、螺甲螨酯、螺虫乙酯、氟啉虫胺脒、虫酰肼、胺菊酯、四氟醚菊酯、噻虫啉、噻虫嗪、硫双威、杀虫双、四溴菊酯、啉蚜威、三氟苯嘧啉、杀铃脲、替环吡啉弗、 ζ -氯氟菊酯、苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素、苏云金芽孢杆菌的所有菌株和核型多角体病毒的所有毒株。

[0680] 用于与本披露的化合物混合的生物剂的一个实施例包括昆虫病原细菌,诸如苏云金芽孢杆菌,以及通过CellCap[®]工艺制备的苏云金芽孢杆菌的包封 δ -内毒素,诸如MVP[®]和MVPII[®]生物杀昆虫剂(CellCap[®]、MVP[®]和MVPII[®]是Mycogen Corporation, Indianapolis, Indiana, USA[麦可根公司,印第安纳波利斯,印第安纳州,美国]的商标);昆虫病原真菌,诸如绿僵菌真菌(green muscardine fungus);和昆虫病原(自然存在的和遗传修饰的)病毒,包括杆状病毒、核型多角体病毒(NPV),诸如谷实夜蛾核型多角体病毒(HzNPV)、芹菜夜蛾核型多角体病毒(Anagrapha falcifera nucleopolyhedrovirus, AfNPV);以及颗粒体病毒(GV),诸如苹果蠹蛾颗粒体病毒(Cydia pomonella granulosis virus, CpGV)。

[0681] 用于与本披露的化合物混合的生物剂的一个实施例包括以下中的一个或组合:
(i)放线菌(Actinomycetes)属、农杆菌(Agrobacterium)属、节杆菌(Arthrobacter)属、产

碱杆菌(*Alcaligenes*)属、金杆菌(*Aureobacterium*)属、固氮菌(*Azobacter*)属、杆菌属、拜叶林克氏菌(*Beijerinckia*)属、慢生根瘤菌(*Bradyrhizobium*)属、短芽孢杆菌(*Brevibacillus*)属、伯克霍尔德(*Burkholderia*)属、色杆菌(*Chromobacterium*)属、梭菌(*Clostridium*)属、棍状杆菌(*Clavibacter*)属、丛毛单胞菌(*Comamonas*)属、棒状杆菌(*Corynebacterium*)属、短小杆菌(*Curtobacterium*)属、肠杆菌(*Enterobacter*)属、黄杆菌(*Flavobacterium*)属、葡萄糖酸杆菌(*Gluconobacter*)属、氢噬胞菌(*Hydrogenophaga*)属、克雷伯氏菌(*Klebsiella*)属、甲基杆菌(*Methylobacterium*)属、类芽孢杆菌(*Paenibacillus*)属、巴斯德氏菌(*Pasteuria*)属、发光杆菌(*Photobacterium*)属、叶杆菌(*Phyllobacterium*)属、假单胞菌(*Pseudomonas*)属、根瘤菌(*Rhizobium*)属、沙雷氏菌(*Serratia*)属、鞘氨醇杆菌(*Sphingobacterium*)属、寡养单胞菌(*Stenotrophomonas*)属、链霉菌(*Streptomyces*)属、贪噬菌(*Variovorax*)属或致病杆菌(*Xenorhabdus*)属细菌,例如解淀粉芽孢杆菌(*Bacillus amyloliquefaciens*)、蜡样芽孢杆菌(*Bacillus cereus*)、坚强芽孢杆菌(*Bacillus firmus*)、地衣芽孢杆菌(*Bacillus licheniformis*)、短小芽孢杆菌(*Bacillus pumilus*)、球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus*)、枯草芽孢杆菌(*Bacillus subtilis*)、苏云金芽孢杆菌、大豆慢生根瘤菌(*Bradyrhizobium japonicum*)、活性紫色细菌(*Chromobacterium subtsugae*)、西泽巴斯德氏芽菌(*Pasteuria nishizawae*)、穿刺巴斯德芽孢菌(*Pasteuria penetrans*)、*Pasteuria usage*、萤光假单胞菌(*Pseudomonas fluorescens*)和利迪链霉菌(*Streptomyces lydicus*)细菌;(ii)真菌,诸如绿僵菌;(iii)病毒,包括杆状病毒、核型多角体病毒,诸如玉米夜蛾核型多角体病毒、芹菜夜蛾核型多角体病毒;颗粒体病毒,诸如苹果蠹蛾颗粒体病毒。

[0682] 特别值得注意的是其中另一无脊椎有害生物防治活性成分属于与式1的化合物不同的化学类别或具有与式1的化合物不同的作用位点的这种组合。在某些情况下,与至少一种具有相似防治谱但是不同作用位点的其他无脊椎有害生物防治活性成分的组合对于抗性管理将是特别有利的。因此,本披露的组合物可以进一步包含生物学有效量的至少一种附加无脊椎有害生物防治活性成分,该活性成分具有相似的防治谱但是属于不同的化学类别或具有不同的作用位点。这些附加生物学活性化合物或试剂包括但不限于乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂,诸如氨基甲酸酯类灭多威、杀线威、硫双威、啉蚜威以及有机磷类毒死蜱;GABA门控氯离子通道拮抗剂,诸如环二烯类狄氏剂和硫丹,以及苯吡啶类乙虫腈和氟虫腈;钠通道调节剂,诸如拟除虫菊酯联苯菊酯、氯氟氰菊酯、 β -氯氟氰菊酯、氯氟氰菊酯、 λ -氯氟氰菊酯、氯氰菊酯、溴氰菊酯、二甲氟氰菊酯、氰戊菊酯、甲氟氰菊酯和异戊菊酯;拟除虫菊酯类(pyrethroids)联苯菊酯、氟氯氰菊酯、高效氟氯氰菊酯、氯氟氰菊酯、高效氯氟氰菊酯、氯氰菊酯、溴氰菊酯、四氟甲醚菊酯、高氰戊菊酯、甲氧苄氟菊酯和丙氟菊酯;烟碱型乙酰胆碱受体(nAChR)激动剂,诸如新烟碱类啉虫脒、噻虫胺、呋虫胺、吡虫啉、烯啶虫胺、硝虫噻嗪、噻虫啉和噻虫嗪、以及氟啶虫胺腈;烟碱型乙酰胆碱受体(nAChR)变构活化剂,诸如多杀菌素类(spinosyns)乙基多杀菌素和多杀菌素;氯通道活化剂,诸如阿维菌素、阿巴汀和甲氨基阿维菌素;保幼激素类似物(juvenile hormone mimics),诸如苯虫醚、烯虫酯、苯氧威和吡丙醚;选择性同翅目取食阻断剂(selective homopteran feeding blocker),诸如吡蚜酮和氟啶虫酰胺;螨虫生长抑制剂,诸如乙螨唑;线粒体ATP合成酶抑制剂,诸如炔螨特;经由破坏质子梯度的氧化磷酸化的偶联剂,诸如溴虫腈;烟碱型乙酰胆碱受体(nAChR)

通道阻断剂,诸如沙蚕毒素类似物(nereistoxin analog)杀螟丹;甲壳素生物合成抑制剂,诸如苯甲酰胺类氟虫脲、氟铃脲、虱螨脲、氟酰胺、多氟脲和杀铃脲、以及噻嗪酮;双翅目蜕皮干扰剂(moulting disrupter),诸如灭蝇胺;蜕皮激素受体激动剂,诸如二芳甲酰基胍类甲氧虫酰肼和虫酰肼;章鱼胺受体激动剂,诸如双甲脒;线粒体复合物III电子传输抑制剂,诸如氟蚁腓;线粒体复合物I电子传输抑制剂,诸如吡蚜灵;电压依赖性钠通道阻断剂,诸如茚虫威;乙酰辅酶A羧化酶抑制剂,诸如季酮酸类和特特拉姆酸类(tetramic acids)螺螨酯、螺甲螨酯和螺虫乙酯;线粒体复合物II电子传输抑制剂,诸如 β -酮腈类腈吡螨酯和丁氟螨酯;苯胺受体调节剂,诸如鱼尼丁受体调节剂,诸如邻甲酰氨基苯甲酰胺类(anthranilic diamides)氯虫苯甲酰胺、溴氰虫酰胺和溴氰虫酰胺,二酰胺类,诸如氟虫双酰胺,以及鱼尼丁受体配体,诸如鱼尼丁;其中对生物学活性负责的靶位点是未知或未表征的化合物,诸如印楝素、联苯胍酯、啉虫丙醚、吡氟啉虫唑和三氟苯嘧啶;昆虫中肠膜的微生物干扰剂,诸如苏云金芽孢杆菌及其产生的 δ -内毒素以及球形芽孢杆菌;以及生物剂,包括核型多角体病毒(NPV)和其他自然存在或遗传改性的杀昆虫病毒。

[0683] 可与本披露化合物一起配制的生物学活性化合物或试剂的其他实例是:杀真菌剂,诸如苯并噻二唑、二甲基吗啉、唑啉菌胺、氨基吡芬(aminopyrifen)、吡唑磺菌胺、敌菌灵、阿扎康唑、噻菌酯、苯霜灵(benlaxyl,包括精苯霜灵(benlaxyl-M))、麦锈灵、苯菌灵、苯噻菌胺(benthiavalicarb,包括苯噻菌胺(benthiavalicarb-isopropyl)、苯并烯氟菌唑、百杀辛(bethoxazin)、乐杀螨、联苯、联苯三唑醇、联苯吡菌胺、灭瘟素(blasticidin-S)、啉酰菌胺(boscalid)、糠菌唑、乙噻吩磺酸酯(bupirimate)、丁硫啉、萎锈灵、环丙酰亚胺、敌菌丹、克菌丹、多菌灵、地茂散(chloroneb)、百菌清、乙菌利(chlozolinate)、氢氧化铜、王铜、硫酸铜、丁香菌酯、赛座灭(cyazofamid)、环氟菌胺、霜脲氰、环唑醇、噻菌环胺、二氯苯塞佐料斯(dichlobentiazox)、抑菌灵、双氯氰菌胺(diclocymet)、吡菌酮(diclomezine)、氯硝胺(dicloran)、乙霉威(diethofencarb)、苯醚甲环唑、氟啉菌胺(diflumerimol)、甲菌定(dimethirimol)、烯酰吗啉、醚菌胺、烯唑醇(diniconazole,包括高效烯唑醇(diniconazole-M))、敌螨普、敌派美创(dipymetitrone)、二噻农(dithianon)、二噻茂烷、十二环吗啉、多果定、益康唑、乙环唑、克瘟散、烯肟菌酯(enoxastrobin,也称为烯肟菌酯(enestroburin))、氟环唑、噻唑菌胺(ethaboxam)、乙菌定(ethirimol)、土菌灵(etridiazole)、噁唑菌酮、咪唑菌酮(fenamidon)、烯肟菌胺、氯苯嘧啶醇、腈苯唑、甲呋酰胺、环酰菌胺(fenhexamide)、稻瘟酰胺(fenoxanil)、拌种咯、苯吡克咪德(fenpicoxamid)、苯锈啉(fenpropidin)、丁苯吗啉、胺苯吡菌酮、三苯基乙酸锡、三苯基氢氧化锡、福美铁、噻菌脒(ferimzone)、氟麦托醌、吡啉菌酰胺(florylpicoxamid)、氟醚菌酰胺、氟啉胺(fluzinam)、氟咯菌腈、氟菌唑、fluindapyr、氟吗啉、氟吡菌胺(fluopicolide)、氟吡菌酰胺、氟噁派若灵(fluxapiprolin)、氟啉菌酯、氟啉唑、氟硅唑、磺菌胺(flusulfamide)、氟噻唑菌腈、氟酰胺(flutolanil)、粉唑醇、氟唑菌酰胺、灭菌丹、稻瘟酞(fthalide,也称为苯酞(phthalide))、麦穗宁、呋霜灵(furalaxyl)、呋吡菌胺、己唑醇、土菌消(hymexazole)、双胍辛盐(guazatine)、抑霉唑、亚胺唑、烷苯磺酸盐(iminoctadine albesilate)、双胍辛胺乙酸盐(iminoctadine triacetate)、茚吡氟胺(inpyrfluxam)、硫双威、种菌唑、依普芬三氟康唑(ipfentrifluconazole)、依普氟芬诺喹(ipflufenquin)、异丙噻菌胺、异稻瘟净(iprobenfos)、异菌脲、丙森锌、异氟普仑(isoflucypram)、稻瘟灵(isoprothiolane)、吡

唑萘菌胺(isopyrazam)、异噻菌胺、春雷霉素、醚菌酯、兰考曲酮(lancotrione)、代森锰锌、双炔酰菌胺(mandipropamid)、曼德斯宾(mandestrobin)、代森锰、密菌胺(mapanipyrin)、氯氟醚菌唑、灭锈胺、消螨多(meptyldinocap)、甲霜灵(包括高效甲霜灵(metalaxyl-M)/精甲霜灵(mefenoxam))、叶菌唑、磺菌威(methasulfocarb)、代森联、苯氧菌胺、美特尔特特拉普罗(metyltetraprole)、苯菌酮、腈菌唑、萘替芬(naftitine)、甲肿铁铵(甲基肿酸铁(ferric methanearsonate))、氟苯嘧啶醇、辛噻酮、呋酰胺、肟醚菌胺、恶霜灵(oxadixyl)、噻啉菌灵(oxathiapiprolin)、奥索利酸、噁咪唑(oxpoconazole)、氧化萎锈灵、土霉素、戊菌唑、戊菌隆(pencycuron)、氟唑菌苯胺、吡噻菌胺(penthiopyrad)、稻痕酯(perfurazoate)、亚磷酸(包括其盐,例如,乙磷铝(fosetyl-aluminm))、啉氧菌酯、哌丙灵(piperalin)、多氧霉素(polyoxin)、噻菌灵、咪鲜胺、腐霉利(procymidone)、霜霉威(propamocarb)、丙环唑、甲基代森锌、碘啉唑酮(proquinazid)、硫菌威(prothiocarb)、丙硫菌唑、氟唑菌酰胺(Adepidyn®)、唑菌胺酯、唑胺菌酯、吡拉吡波尼(pyrapropoyne)、唑菌酯、联苯吡啉菌胺(pyraziflumid)、吡菌磷、吡菌苯威、吡布塔威(pyributacarb)、吡氯美蒂(pyridachlometyl)、啉斑肟(pyrifenox)、苯啉菌酮(pyriofenone)、皮里索萨唑(perisoxazole)、嘧霉胺(pyrimethanil)、啉斑肟、硝吡咯菌素(pyrrolnitrin)、咯嗉酮(pyroquilon)、氟啉唑、灭螨猛(quinmethionate)、啉氟密灵(quinofumelin)、啉氧灵、五氯硝基苯、硅噻菌胺(silthiofam)、氟唑环菌胺(sedaxane)、硅氟唑(simeconazole)、螺环菌胺、链霉素、硫、戊唑醇、异丁乙氧啉、叶枯酞(teclofthalam)、叶枯酞、四氯硝基苯、特比萘芬、氟醚唑、噻苯达唑、噻呋酰胺、托布津、甲基托布津、塞仑、噻酰菌胺、甲基立枯磷、三氟甲氧威(tolprocarb)、甲苯氟磺胺、三唑酮、三唑醇、嘧菌醇、咪唑啉(triazoxide)、碱式硫酸铜(tribasic copper sulfate)、氯啉菌酯、十三吗啉、肟菌酯、氟菌唑、三莫啉三环唑(trimoprhamide tricyclazole)、肟菌酯、啉氨灵、灭菌唑、烯效唑(uniconazole)、有效霉素、缬菌胺(valifenalate,也称为缬菌胺(valifenal))、乙烯菌核利(vinclozoline)、代森锌、福美锌、苯酰菌胺(zoxamide)和1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-3-异噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮;杀线虫剂,诸如氟吡菌酰胺、螺虫乙酯、硫双威、噻唑膦、阿巴汀、异菌脲、联氟砒、二甲基二硫化物、噻唑沙芬、1,3-二氯丙烯(1,3-D)、威百亩(钠和钾)、棉隆、氯化苦、苯线磷(fenamiphos)、灭线磷、硫线磷(cadusaphos)、特丁硫磷、咪唑环磷(imicyafos)、杀线威、克百威、噻唑沙芬(tioxazafen)、坚强芽孢杆菌和西泽巴斯德氏芽菌;杀菌剂,诸如链霉素;杀螨剂,诸如双甲脒、灭螨猛、乙酯杀螨醇、三环锡(cyhexatin)、三氯杀螨醇、除螨灵、乙螨唑、啉啉醚、苯丁锡、甲氧菊酯、啉啉酯、噻啉酮、克螨特、啉啉灵和吡啉胺。

[0684] 在某些情况下,本披露的化合物与其他生物学活性(特别是无脊椎有害生物防治)化合物或药剂(即活性成分)的组合可导致增强的效应。降低释放在环境中的活性成分的量,同时确保有效的有害生物控制一直是人们所期望的。当增强的无脊椎有害生物防治以获得农学上令人满意的无脊椎有害生物防治水平的施加量出现时,此类组合可有利地用于降低作物生产成本并且减少环境负荷。

[0685] 可以将本披露的化合物及其组合物施用于经基因转化以表达对无脊椎有害生物有毒的蛋白质(诸如苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素)的植物。此种施用可提供更广谱的植物保护,并且对于抗性管理是有利的。本披露的外源性施加的无脊椎有害生物防治化合物与表

达的毒素蛋白质组合可提供增强的效应。

[0686] 这些农用保护剂(即杀昆虫剂、杀真菌剂、杀线虫剂、杀螨剂、除草剂和生物剂)的一般参考文献包括The Pesticide Manual[农药手册],第13版,C.D.S.Tomlin编辑,British Crop Protection Council[英国作物保护委员会],Farnham,Surrey,U.K.[英国萨里法纳姆],2003和The BioPesticide Manual[生物农药手册],第2版,L.G.Copping编辑,英国作物保护委员会,Farnham,Surrey,U.K.[英国萨里法纳姆],2001。

[0687] 本披露的化合物可与多核苷酸组合或一起配制,这些多核苷酸包括但不限于DNA、RNA和/或化学修饰的核苷酸,这些核苷酸通过减量调节、干扰、抑制或沉默呈现杀昆虫效果的遗传衍生的转录物来影响特定靶的量。

[0688] 对于其中使用这些不同混合组分中的一种或多种的实施例,这些不同混合组分(总量)与式1的化合物的重量比典型地在约1:3000与约3000:1之间。值得注意的是在约1:300与约300:1之间的重量比(例如在约1:30与约30:1之间的比率)。本领域技术人员可以通过简单的实验容易地确定所希望的生物学活性谱所必需的活性成分的生物学有效量。将明显的是,包含这些附加组分可使无脊椎有害生物防治谱扩展超出由单独的式1的化合物的防治谱。

[0689] 表A列出了式1的化合物与其他无脊椎有害生物控制剂的具体组合,例证了本披露的混合物、组合物和方法。表A的第一列列出了具体的无脊椎有害生物控制剂(例如,第一行中的“阿巴汀”)。表A的第二列列出了无脊椎有害生物控制剂的作用方式(如果已知的话)或化学类别。表A的第三列列出了无脊椎有害生物控制剂可以相对于式1的化合物施用的比率的重量比范围的一个或多个实施例(例如,按重量计,阿巴汀相对于式1的化合物为“50:1至1:50”)。因此,例如,表A的第一行具体披露了式1的化合物与阿巴汀的组合可以以50:1至1:50之间的重量比施用。表A的其余行将被类似地构造。进一步值得注意的是,表A列出了式1的化合物与其他无脊椎有害生物控制剂的具体组合,例证了本披露的混合物、组合物和方法,并且包括施用量的重量比范围的附加实施例。

[0690] 表A

[0691]

无脊椎有害生物控制剂	作用方式或化学类别	典型的重量比
阿巴汀	氯离子通道激活剂	50 : 1 至 1 : 50
吡虫脒	烟碱型乙酰胆碱受体 (nAChR) 激动剂	150 : 1 至 1 : 200
双甲脒	章鱼胺受体激动剂	200 : 1 至 1 : 100
阿维菌素	大环内酯	50 : 1 至 1 : 50
印楝素	未知的作用位点	100 : 1 至 1 : 120
高效氟氯氰菊酯	钠通道调节剂	150 : 1 至 1 : 200
联苯菊酯	钠通道调节剂	100 : 1 至 1 : 10
噻嗪酮	甲壳素生物合成抑制剂	500 : 1 至 1 : 50
杀螟丹	烟碱型乙酰胆碱受体 (nAChR) 通道阻断剂	100 : 1 至 1 : 200
氯虫苯甲酰胺	兰尼碱受体调节剂	100 : 1 至 1 : 120
溴虫腈	氧化磷酸化的解偶联剂	300 : 1 至 1 : 200
毒死蜱	乙酰胆碱酯酶抑制剂	500 : 1 至 1 : 200
噻虫胺	烟碱型乙酰胆碱受体 (nAChR) 激动剂	100 : 1 至 1 : 400
溴氰虫酰胺	兰尼碱受体调节剂	100 : 1 至 1 : 120
氟氯氰菊酯	钠通道调节剂	150 : 1 至 1 : 200

[0692]

无脊椎有害生物控制剂	作用方式或化学类别	典型的重量比
三氟氰菊酯	钠通道调节剂	150 : 1 至 1 : 200
氰菊酯	钠通道调节剂	150 : 1 至 1 : 200
灭蝇胺	双翅目蜕皮干扰剂	400 : 1 至 1 : 50
溴氰菊酯	钠通道调节剂	50 : 1 至 1 : 400
狄氏剂	GABA 门控氯离子通道拮抗剂	200 : 1 至 1 : 100
呋虫胺	烟碱型乙酰胆碱受体 (nAChR) 激动剂	150 : 1 至 1 : 200
苯虫醚	保幼激素类似物	150 : 1 至 1 : 200
甲氨基阿维菌素	氯离子通道激活剂	50 : 1 至 1 : 10
硫丹	GABA 门控氯离子通道拮抗剂	200 : 1 至 1 : 100
高氰戊菊酯	钠通道调节剂	100 : 1 至 1 : 400
乙虫腈	GABA 调节氯离子通道拮抗剂	200 : 1 至 1 : 100
苯硫威		150 : 1 至 1 : 200
苯氧威	保幼激素类似物	500 : 1 至 1 : 100
氰戊菊酯	钠通道调节剂	150 : 1 至 1 : 200
氟虫腈	GABA 调节氯离子通道拮抗剂	150 : 1 至 1 : 100
氟啶虫酰胺	选择性半翅目取食阻断剂	200 : 1 至 1 : 100
氟虫双酰胺	兰尼碱受体调节剂	100 : 1 至 1 : 120
氟虫脲	甲壳素生物合成抑制剂	200 : 1 至 1 : 100
氟铃脲	甲壳素生物合成抑制剂	300 : 1 至 1 : 50
氟蚁脞	线粒体复合物 III 电子传输抑制 剂	150 : 1 至 1 : 250
吡虫啉	烟碱型乙酰胆碱受体 (nAChR) 激动剂	1000 : 1 至 1 : 1000
茚虫威	电压依赖性钠通道阻断剂	200 : 1 至 1 : 50
高效氰氟氰菊酯	钠通道调节剂	50 : 1 至 1 : 250

[0693]

无脊椎有害生物控制剂	作用方式或化学类别	典型的重量比
虱螨脲	甲壳素生物合成抑制剂	500 : 1 至 1 : 250
氰氟虫腚	电压依赖性钠通道阻断剂	200 : 1 至 1 : 200
灭多威	乙酰胆碱酯酶抑制剂	500 : 1 至 1 : 100
烯虫酯	保幼激素类似物	500 : 1 至 1 : 100
甲氧虫酰肼	蜕皮激素受体激动剂	50 : 1 至 1 : 50
烯啶虫胺	烟碱型乙酰胆碱受体 (nAChR) 激动剂	150 : 1 至 1 : 200
硝虫噻嗪	烟碱型乙酰胆碱受体 (nAChR) 激动剂	150 : 1 至 1 : 200
氟啶脲	甲壳素生物合成抑制剂	500 : 1 至 1 : 150
杀线威	乙酰胆碱酯酶抑制剂	200 : 1 至 1 : 200
吡蚜酮	选择性半翅目取食阻断剂	200 : 1 至 1 : 100
除虫菊素	钠通道调节剂	100 : 1 至 1 : 10
哒螨灵	线粒体复合物 I 电子传输抑制剂	200 : 1 至 1 : 100
啶虫丙醚	未知的作用位点	200 : 1 至 1 : 100
吡丙醚	保幼激素类似物	500 : 1 至 1 : 100
兰尼碱	兰尼碱受体配体	100 : 1 至 1 : 120
乙基多杀菌素	烟碱型乙酰胆碱受体 (nAChR) 变构活化剂	150 : 1 至 1 : 100
多杀菌素	烟碱型乙酰胆碱受体 (nAChR) 变构活化剂	500 : 1 至 1 : 10
螺螨酯	乙酰辅酶 A 羧化酶抑制剂	200 : 1 至 1 : 200
螺甲螨酯	乙酰辅酶 A 羧化酶抑制剂	200 : 1 至 1 : 200
虫酰肼	蜕皮激素受体激动剂	500 : 1 至 1 : 250
噻虫啉	烟碱型乙酰胆碱受体 (nAChR) 激动剂	100 : 1 至 1 : 200

无脊椎有害生物控制剂	作用方式或化学类别	典型的重量比
噻虫嗪	烟碱型乙酰胆碱受体 (nAChR) 激动剂	1250 : 1 至 1 : 1000
硫双威	乙酰胆碱酯酶抑制剂	500 : 1 至 1 : 400
杀虫双	烟碱型乙酰胆碱受体 (nAChR) 通道阻断剂	150 : 1 至 1 : 100
[0694] 四溴菊酯	钠通道调节剂	150 : 1 至 1 : 200
唑蚜威	乙酰胆碱酯酶抑制剂	250 : 1 至 1 : 100
三氟苯嘧啶		
杀铃脲	甲壳素合成抑制剂	200 : 1 至 1 : 100
苏云金芽孢杆菌	生物剂	50 : 1 至 1 : 10
苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素	生物剂	50 : 1 至 1 : 10
NPV (例如, Gemstar)	生物剂	50 : 1 至 1 : 10

[0695] 值得注意的是本披露的组合物,其中至少一种附加生物学活性化合物或试剂选自上表A中列出的无脊椎有害生物控制剂。

[0696] 包括式1的化合物、其N-氧化物或盐的化合物与附加无脊椎有害生物控制剂的重量比典型地在1000:1与1:1000之间,其中一个实施例在500:1与1:500之间,另一个实施例在250:1与1:200之间,并且另一个实施例在100:1与1:50之间。

[0697] 以下表B1中列出了包含式1的化合物(化合物编号(Cmpd.No.)是指索引表A中的化合物)和附加无脊椎有害生物控制剂的具体组合物的实施例。

[0698] 表B1

混合物 编号	化合 物 编号	以及	无脊椎有害生物 控制剂	混合物 编号	化合 物 编号	以及	无脊椎有害生物 控制剂
[0699] B1-1	1	以及	阿巴汀	B1-38	1	以及	茚虫威
B1-2	1	以及	啉虫脒	B1-39	1	以及	高效氯氟氰菊酯
B1-3	1	以及	双甲脒	B1-40	1	以及	虱螨脲

[0700]

混合物 编号	化合 物 编号	以及	无脊椎有害生物 控制剂	混合物 编号	化合 物 编号	以及	无脊椎有害生物 控制剂
B1-4	1	以及	阿维菌素	B1-41	1	以及	氟氟虫脒
B1-5	1	以及	印楝素	B1-42	1	以及	灭多威
B1-6	1	以及	杀虫磺	B1-43	1	以及	烯虫酯
B1-7	1	以及	高效氟氯氟菊酯	B1-44	1	以及	甲氧虫酰肼
B1-8	1	以及	联苯菊酯	B1-45	1	以及	烯啶虫胺
B1-9	1	以及	噻嗪酮	B1-46	1	以及	硝虫噻嗪
B1-10	1	以及	杀螟丹	B1-47	1	以及	氟酰胺
B1-11	1	以及	氯虫苯甲酰胺	B1-48	1	以及	杀线威
B1-12	1	以及	溴虫腈	B1-49	1	以及	亚胺硫磷
B1-13	1	以及	毒死蜱	B1-50	1	以及	吡蚜酮
B1-14	1	以及	噻虫胺	B1-51	1	以及	除虫菊素
B1-15	1	以及	溴氟虫酰胺	B1-52	1	以及	哒螨灵
B1-16	1	以及	氟氯氟菊酯	B1-53	1	以及	啉虫丙醚
B1-17	1	以及	三氟氯氟菊酯	B1-54	1	以及	吡丙醚
B1-18	1	以及	氯氟菊酯	B1-55	1	以及	兰尼碱
B1-19	1	以及	灭蝇胺	B1-56	1	以及	乙基多杀菌素
B1-20	1	以及	溴氟菊酯	B1-57	1	以及	多杀菌素
B1-21	1	以及	狄氏剂	B1-58	1	以及	螺螨酯
B1-22	1	以及	呋虫胺	B1-59	1	以及	螺甲螨酯
B1-23	1	以及	苯虫醚	B1-60	1	以及	螺虫乙酯
B1-24	1	以及	甲氨基阿维菌素	B1-61	1	以及	氟啉虫胺脒
B1-25	1	以及	硫丹	B1-62	1	以及	虫酰肼
B1-26	1	以及	高氟戊菊酯	B1-63	1	以及	七氟菊酯
B1-27	1	以及	乙虫腈	B1-64	1	以及	噻虫啉
B1-28	1	以及	苯硫威	B1-65	1	以及	噻虫嗪
B1-29	1	以及	苯氧威	B1-66	1	以及	硫双威
B1-30	1	以及	氟戊菊酯	B1-67	1	以及	杀虫双

[0701]	混合物 编号	化合 物 编号	以及	无脊椎有害生物 控制剂	混合物 编号	化合 物 编号	以及	无脊椎有害生物 控制剂
	B1-31	1	以及	氟虫腈	B1-68	1	以及	唑虫酰胺
	B1-32	1	以及	氟啶虫酰胺	B1-69	1	以及	四溴菊酯
	B1-33	1	以及	氟虫双酰胺	B1-70	1	以及	啉蚜威
	B1-34	1	以及	氟虫脲	B1-71	1	以及	三氟苯嘧啶
	B1-35	1	以及	氟铃脲	B1-72	1	以及	杀铃脲
	B1-36	1	以及	氟蚁脲	B1-73	1	以及	苏云金芽孢杆菌
	B1-37	1	以及	吡虫啉	B1-74	1	以及	苏云金芽孢杆菌 δ-内毒素
				B1-75	1	以及	NPV (例如, Gemstar)	

[0702] 表B1中所列出的具体混合物典型地以表A中所指定的比率将式1的化合物与其他无脊椎有害生物药剂组合。

[0703] 以下表C1中列出了包含式1的化合物(化合物编号(Cmpd.No.)是指索引表A中的化合物)和附加无脊椎有害生物控制剂的具体混合物。表C1进一步列出了表C1的混合物的典型特定重量比。例如,表C1的第一行的第一重量比条目具体披露了以100份化合物1比1份阿巴汀的重量比施用的索引表A的化合物1与阿巴汀的混合物。

[0704] 表C1

混合 物编 号	化合 物编 号	以 及	无脊椎有害生物 控制剂	典型的混合物比率 (按重量计)								
				100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
[0705] C1-1	1	以 及	阿巴汀	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-2	1	以 及	啉虫脒	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-3	1	以	双甲脒	100 :	10 :	5 :	2 :	1 :	1 :	1 :	1 :	1 :

[0706]

混合物编号	化合物编号	以 及 无脊椎有害生物 控制剂	典型的混合物比率 (按重量计)								
			1	1	1	1	1	2	5	10	100
C1-4	1	以 及 阿维菌素	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-5	1	以 及 印楝素	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-6	1	以 及 杀虫磺	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-7	1	以 及 高效氟氯菊酯	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-8	1	以 及 联苯菊酯	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-9	1	以 及 噻嗪酮	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-10	1	以 及 杀螟丹	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-11	1	以 及 氯虫苯甲酰胺	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-12	1	以 及 溴虫腈	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-13	1	以 及 毒死蜱	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-14	1	以 及 噻虫胺	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-15	1	以 及 溴氟虫酰胺	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-16	1	以 及 氟氯菊酯	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100

[0707]

混合物编号	化合物编号	以及无脊椎有害生物控制剂	典型的混合物比率 (按重量计)									
			100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-17	1	以及三氟氯氰菊酯	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-18	1	以及氯氰菊酯	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-19	1	以及灭蝇胺	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-20	1	以及溴氰菊酯	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-21	1	以及狄氏剂	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-22	1	以及啶虫脒	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-23	1	以及苯虫醚	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-24	1	以及甲氨基阿维菌素	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-25	1	以及硫丹	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-26	1	以及高氯戊菊酯	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-27	1	以及乙虫腈	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-28	1	以及苯硫威	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-29	1	以及苯氧威	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-30	1	以及氯戊菊酯	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:1	1:1	1:1	1:1	

[0708]

混合物编号	化合物编号	以 及 无脊椎有害生物 控制剂	典型的混合物比率 (按重量计)								
			1	1	1	1	1	2	5	10	100
C1-31	1	以 及 氟虫腈	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-32	1	以 及 氟啶虫酰胺	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-33	1	以 及 氟虫双酰胺	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-34	1	以 及 氟虫脲	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-35	1	以 及 氟铃脲	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-36	1	以 及 氟蚁脲	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-37	1	以 及 吡虫啉	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-38	1	以 及 茚虫威	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-39	1	以 及 高效氯氟氯菊酯	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-40	1	以 及 虱螨脲	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-41	1	以 及 氟氟虫脲	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-42	1	以 及 灭多威	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100
C1-43	1	以 及 烯虫酯	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100

[0709]

混合物编号	化合物编号	以及无脊椎有害生物控制剂	典型的混合物比率 (按重量计)									
			100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100	
C1-44	1	以及甲氧虫酰肼	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100	
C1-45	1	以及烯啶虫胺	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100	
C1-46	1	以及硝虫噻嗪	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100	
C1-47	1	以及氟酰脲	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100	
C1-48	1	以及杀线威	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100	
C1-49	1	以及亚胺硫磷	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100	
C1-50	1	以及吡蚜酮	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100	
C1-51	1	以及除虫菊素	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100	
C1-52	1	以及哒螨灵	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100	
C1-53	1	以及啶虫丙醚	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100	
C1-54	1	以及吡丙醚	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100	
C1-55	1	以及兰尼碱	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100	
C1-56	1	以及乙基多杀菌素	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100	
C1-57	1	以及多杀菌素	100 : 1	10 : 1	5 : 1	2 : 1	1 : 1	1 : 2	1 : 5	1 : 10	1 : 100	

[0710]

混合物编号	化合物编号	以 及 无脊椎有害生物 控制剂	典型的混合物比率 (按重量计)									
			1	1	1	1	1	2	5	10	100	
		及	100:	10:	5:	2:	1:	1:	1:	1:	1:	1:
		及	1	1	1	1	1	2	5	10	100	100
C1-58	1	以 及 螺螨酯	100:	10:	5:	2:	1:	1:	1:	1:	1:	1:
		及	1	1	1	1	1	2	5	10	100	100
C1-59	1	以 及 螺甲螨酯	100:	10:	5:	2:	1:	1:	1:	1:	1:	1:
		及	1	1	1	1	1	2	5	10	100	100
C1-60	1	以 及 螺虫乙酯	100:	10:	5:	2:	1:	1:	1:	1:	1:	1:
		及	1	1	1	1	1	2	5	10	100	100
C1-61	1	以 及 氟啶虫胺胍	100:	10:	5:	2:	1:	1:	1:	1:	1:	1:
		及	1	1	1	1	1	2	5	10	100	100
C1-62	1	以 及 虫酰肼	100:	10:	5:	2:	1:	1:	1:	1:	1:	1:
		及	1	1	1	1	1	2	5	10	100	100
C1-63	1	以 及 七氟菊酯	100:	10:	5:	2:	1:	1:	1:	1:	1:	1:
		及	1	1	1	1	1	2	5	10	100	100
C1-64	1	以 及 噻虫啉	100:	10:	5:	2:	1:	1:	1:	1:	1:	1:
		及	1	1	1	1	1	2	5	10	100	100
C1-65	1	以 及 噻虫嗪	100:	10:	5:	2:	1:	1:	1:	1:	1:	1:
		及	1	1	1	1	1	2	5	10	100	100
C1-66	1	以 及 硫双威	100:	10:	5:	2:	1:	1:	1:	1:	1:	1:
		及	1	1	1	1	1	2	5	10	100	100
C1-67	1	以 及 杀虫双	100:	10:	5:	2:	1:	1:	1:	1:	1:	1:
		及	1	1	1	1	1	2	5	10	100	100
C1-68	1	以 及 唑虫酰胺	100:	10:	5:	2:	1:	1:	1:	1:	1:	1:
		及	1	1	1	1	1	2	5	10	100	100
C1-69	1	以 及 四溴菊酯	100:	10:	5:	2:	1:	1:	1:	1:	1:	1:
		及	1	1	1	1	1	2	5	10	100	100
C1-70	1	以 及 唑蚜威	100:	10:	5:	2:	1:	1:	1:	1:	1:	1:
		及	1	1	1	1	1	2	5	10	100	100

混合物编号	化合物编号	以及无脊椎有害生物控制剂	典型的混合物比率 (按重量计)									
			100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
[0711] C1-71	1	以及三氟苯嘧啶	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-72	1	以及杀铃脲	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-73	1	以及苏云金芽孢杆菌	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-74	1	以及苏云金芽孢杆菌 δ-内毒素	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-75	1	以及NPV (例如, Gemstar)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	

[0712] 以下表D1中列出了包含式1的化合物(化合物编号(Cmpd.No.)是指索引表A中的化合物)和附加杀真菌剂的具体组合物的实施例。

[0713] 表D1

混合物编号	化合物编号	以及杀真菌剂	混合物编号	化合物编号	以及杀真菌剂
[0714] D1-1	1	以及噻菌灵	D1-17	1	以及苯醚甲环唑
D1-2	1	以及噻酰菌胺	D1-18	1	以及环丙唑醇
D1-3	1	以及异噻菌胺	D1-19	1	以及丙环唑
D1-4	1	以及咯嗉酮	D1-20	1	以及稻瘟酰胺
D1-5	1	以及苯氧菌胺	D1-21	1	以及噻菌胺
D1-6	1	以及氟酰胺	D1-22	1	以及稻瘟酞
D1-7	1	以及有效霉素	D1-23	1	以及春雷霉素
D1-8	1	以及呋吡菌胺	D1-24	1	以及啉氧菌酯
D1-9	1	以及戊菌隆	D1-25	1	以及吡噻菌胺
D1-10	1	以及硅氟唑	D1-26	1	以及噁唑菌酮
D1-11	1	以及肟醚菌胺	D1-27	1	以及霜脲氰
D1-12	1	以及肟菌酯	D1-28	1	以及丙氧喹啉

混合物 编号	化合物 编号	以及	杀真菌剂	混合物 编号	化合物 编号	以及	杀真菌剂	
[0715]	D1-13	1	以及	稻瘟灵	D1-29	1	以及	氟硅唑
	D1-14	1	以及	嘧菌酯	D1-30	1	以及	代森锰锌
	D1-15	1	以及	三环唑	D1-31	1	以及	氢氧化铜
	D1-16	1	以及	己唑醇	D1-32	1	以及	噻啉菌灵

[0716] 在农学和非农学应用中,通过将生物学有效量的一种或多种通常呈组合物形式的本披露的化合物施用到有害生物环境中,包括侵害的农学和/或非农学场所,施用到待保护的区域中,或直接施用到待防治的有害生物上,来防治无脊椎有害生物。

[0717] 因此,本披露包括一种用于在农学和/或非农业应用中防治无脊椎有害生物的方法,该方法包括使无脊椎有害生物或其环境与生物学有效量的一种或多种本披露的化合物或与包含至少一种这样的化合物的组合物或包含至少一种这样的化合物和生物学有效量的至少一种附加生物学活性化合物或药剂的组合物接触。包含本披露的化合物和生物学有效量的至少一种附加生物学活性化合物或药剂的合适组合物的实例包括颗粒状组合物,其中该附加活性化合物存在于与本披露的化合物相同的颗粒上或存在于与本披露的化合物的那些颗粒分开的颗粒上。

[0718] 为实现与本披露的化合物或组合物接触以保护大田作物免受无脊椎有害生物的危害,通常在种植之前将该化合物或组合物施用到作物种子上,施用到作物植株的叶子(例如,叶、茎、花、果实)上,或在种植作物之前或之后施用到土壤或其他生长介质上。

[0719] 接触方法的一个实施例是通过喷雾。替代性地,包含本披露的化合物的颗粒状组合物可以施加到植物叶子或土壤。也可以通过使植株与作为液体制剂的土壤浸液、到土壤中的颗粒状制剂、育苗箱处理物或移植浸渍液施加的包含本披露的化合物的组合物接触来通过植物吸收有效地递送本披露的化合物。值得注意的是呈土壤浸液液体制剂形式的本披露的组合物。还值得注意的是用于防治无脊椎有害生物的方法,该方法包括使无脊椎有害生物或其环境与生物学有效量的本披露的化合物或与包含生物学有效量的本披露的化合物的组合物接触。进一步值得注意的是这种方法,其中环境是土壤并且该组合物作为土壤浸液制剂施用到土壤中。进一步值得注意的是还通过局部施用到侵害的场所来使本披露的化合物是有效的。其他接触方法包括通过直接喷雾和滞留喷雾、空气喷雾、凝胶、种子包衣、微胶囊化、内吸吸收、诱饵、耳标、大丸药、喷雾器、熏剂、气溶胶、粉剂以及许多其他方法来施加本披露的化合物或组合物。接触方法的一个实施例是包含本披露的化合物或组合物的尺寸上稳定的肥料颗粒、小棒或片剂。本披露的化合物还可浸渍到用于制造无脊椎有害生物防治装置(例如,防昆虫网)的材料中。

[0720] 本披露的化合物可用于处理所有植物、植物部分和种子。植物和种子品种和栽培品系可通过常规的繁殖和育种方法或通过基因工程方法获得。经遗传修饰的植株或种子(转基因植物或种子)是其中异源性基因(转基因)已被稳定整合进植株或种子基因组中的那些。由转基因在植株基因组中的特定位置所限定的转基因被称为转化或转基因事件。

[0721] 可根据本披露处理的经基因修饰的植物和种子栽培品系包括抵抗一种或多种生

物胁迫的那些(有害生物,诸如线虫、昆虫、螨虫、真菌等)或非生物胁迫(干旱、低温、土壤盐化等),或包含其他期望的特征的那些。植物和种子可经基因修饰以表现出性状,例如除草剂耐受性、昆虫抗性、修饰的油特征或耐旱性。包括单个基因转化事件或转化事件的组合的有用的经遗传修饰的植株和种子列出于表Z中。对于表Z中列出的遗传修饰的附加信息可获自以下数据库:

[0722] <http://www2.oecd.org/biotech/byidentifier.aspx>

[0723] <http://www.aphis.usda.gov>

[0724] <http://gmoinfo.jrc.ec.europa.eu>

[0725] 以下缩写用于随后的表Z中:tol.为耐受性,res.为抗性,SU为磺酰脲类,ALS为乙酰乳酸合酶,HPPD为4-羟基苯丙酮酸双加氧酶,NA为不可用。

[0726] 表Z

	作物	事件名称	事件代码	性状	基因
[0727]	苜蓿	J101	MON-00101-8	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA : CP4)
	苜蓿	J163	MON-00163-7	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA :

	低芥酸菜籽*	23-18-17(事件 18)	CGN-89465-2	高月桂酸油	CP4) te
	低芥酸菜籽*	23-198 (事件 23)	CGN-89465-2	高月桂酸油	te
	低芥酸菜籽*	61061	DP-Ø61Ø61-7	草甘膦耐受性	gat4621
	低芥酸菜籽*	73496	DP-Ø73496-4	草甘膦耐受性	gat4621
	低芥酸菜籽*	GT200 (RT200)	MON-89249-2	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	低芥酸菜籽*	GT73 (RT73)	MON-ØØØ73-7	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA : CP4); goxv247
	低芥酸菜籽*	HCN10 (Topas 19/2)	NA	草丁膦耐受性	bar
	低芥酸菜籽*	HCN28 (T45)	ACS-BNØØ8-2	草丁膦耐受性	pat (syn)
	低芥酸菜籽*	HCN92 (Topas 19/2)	ACS-BNØØ7-1	草丁膦耐受性	bar
[0728]	低芥酸菜籽*	MON88302	MON-883Ø2-9	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA : CP4)
	低芥酸菜籽*	MPS961	NA	植酸分解	phyA
	低芥酸菜籽*	MPS962	NA	植酸分解	phyA
	低芥酸菜籽*	MPS963	NA	植酸分解	phyA
	低芥酸菜籽*	MPS964	NA	植酸分解	phyA
	低芥酸菜籽*	MPS965	NA	植酸分解	phyA
	低芥酸菜籽*	MS1 (B91-4)	ACS-BNØØ4-7	草丁膦耐受性	bar
	低芥酸菜籽*	MS8	ACS-BNØØ5-8	草丁膦耐受性	bar
	低芥酸菜籽*	OXY-235	ACS-BNØ11-5	苯腈类耐受性	bxn
	低芥酸菜籽*	PHY14	NA	草丁膦耐受性	bar
	低芥酸菜籽*	PHY23	NA	草丁膦耐受性	bar
	低芥酸菜籽*	PHY35	NA	草丁膦耐受性	bar
	低芥酸菜籽*	PHY36	NA	草丁膦耐受性	bar
	低芥酸菜籽*	RF1 (B93-101)	ACS-BNØØ1-4	草丁膦耐受性	bar

[0729]	低芥酸菜籽*	RF2 (B94-2)	ACS-BN002-5	草丁膦耐受性	bar
	低芥酸菜籽*	RF3	ACS-BN003-6	草丁膦耐受性	bar
	豆	EMBRAPA 5.1	EMB-PV051-1	疾病抗性	ac1 (有义和反义)
	茄子	EE-1		昆虫抗性	cry1Ac
	康乃馨	11 (7442)	FLO-07442-4	磺酰脲类耐受性; 改变的花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
	康乃馨	11363 (1363A)	FLO-11363-1	磺酰脲类耐受性; 改变的花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
	康乃馨	1226A (11226)	FLO-11226-8	磺酰脲类耐受性; 改变的花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
	康乃馨	123.2.2 (40619)	FLO-40619-7	磺酰脲类耐受性; 改变的花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
	康乃馨	123.2.38 (40644)	FLO-40644-4	磺酰脲类耐受性; 改变的花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
	康乃馨	123.8.12	FLO-40689-6	磺酰脲类耐受性; 改变的花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
	康乃馨	123.8.8 (40685)	FLO-40685-1	磺酰脲类耐受性; 改变的花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
	康乃馨	1351A (11351)	FLO-11351-7	磺酰脲类耐受性; 改变的花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
康乃馨	1400A (11400)	FLO-11400-2	磺酰脲类耐受性	surB; dfr; bp40	

[0730]	康乃馨	15	FLO-00015-2	性; 改变的花色 磺酰脲类耐受性; 改变的花色	(f3'5'h) surB; dfr; hfl (f3'5'h)
	康乃馨	16	FLO-00016-3	磺酰脲类耐受性; 改变的花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
	康乃馨	4	FLO-00004-9	磺酰脲类耐受性; 改变的花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
	康乃馨	66	FLO-00066-8	磺酰脲类耐受性; 延迟衰老	surB; acc
	康乃馨	959A (11959)	FLO-11959-3	磺酰脲类耐受性; 改变的花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
	康乃馨	988A (11988)	FLO-11988-7	磺酰脲类耐受性; 改变的花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
	康乃馨	26407	IFD-26497-2	磺酰脲类耐受性; 改变的花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
	康乃馨	25958	IFD-25958-3	磺酰脲类耐受性; 改变的花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
	菊苣	RM3-3	NA	草丁膦耐受性	bar
	菊苣	RM3-4	NA	草丁膦耐受性	bar
菊苣	RM3-6	NA	草丁膦耐受性	bar	
棉	19-51a	DD-01951A-7	乙酰乳酸合成酶除草剂耐受	S4-HrA	

[0731]	棉	281-24-236	DAS-24236-5	性 草丁膦耐受性; 昆虫抗性	pat (syn); cry1F
	棉	3006-210-23	DAS-21023-5	草丁膦耐受性; 昆虫抗性	pat (syn); cry1Ac
	棉	31707	NA	苯腈类耐受性; 昆虫抗性	bxn; cry1Ac
	棉	31803	NA	苯腈类耐受性; 昆虫抗性	bxn; cry1Ac
	棉	31807	NA	苯腈类耐受性; 昆虫抗性	bxn; cry1Ac
	棉	31808	NA	苯腈类耐受性; 昆虫抗性	bxn; cry1Ac
	棉	42317	NA	苯腈类耐受性; 昆虫抗性	bxn; cry1Ac
	棉	BNLA-601	NA	昆虫抗性	cry1Ac
	棉	BXN10211	BXN10211-9	苯腈类耐受性	bxn; cry1Ac
	棉	BXN10215	BXN10215-4	苯腈类耐受性	bxn; cry1Ac
	棉	BXN10222	BXN10222-2	苯腈类耐受性	bxn; cry1Ac
	棉	BXN10224	BXN10224-4	苯腈类耐受性	bxn; cry1Ac
	棉	COT102	SYN-IR102-7	昆虫抗性	vip3A(a)
	棉	COT67B	SYN-IR67B-1	昆虫抗性	cry1Ab
	棉	COT202		昆虫抗性	vip3A
	棉	事件 1	NA	昆虫抗性	cry1Ac
	棉	GMF Cry1A	GTL-GMF311-7	昆虫抗性	cry1Ab-Ac
	棉	GHB119	BCS-GH005-8	昆虫抗性	cry2Ac
	棉	GHB614	BCS-GH002-5	草甘膦耐受性	2mepsps
	棉	GK12	NA	昆虫抗性	cry1Ab-Ac
	棉	LLCotton25	ACS-GH001-3	草丁膦耐受性	bar
棉	MLS 9124	NA	昆虫抗性	cry1C	

	棉	MON1076	MON-89924-2	昆虫抗性	cry1Ac
	棉	MON1445	MON-01445-2	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA : CP4)
	棉	MON15985	MON-15985-7	昆虫抗性	cry1Ac; cry2Ab2
	棉	MON1698	MON-89383-1	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA : CP4)
	棉	MON531	MON-00531-6	昆虫抗性	cry1Ac
	棉	MON757	MON-00757-7	昆虫抗性	cry1Ac
	棉	MON88913	MON-88913-8	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA : CP4)
	棉	Nqwe Chi 6 Bt	NA	昆虫抗性	NA?
	棉	SKG321	NA	昆虫抗性	cry1A; CpTI
	棉	T303-3	BCS-GH003-6	昆虫抗性; 草丁膦耐受性	cry1Ab; bar
[0732]	棉	T304-40	BCS-GH004-7	昆虫抗性; 草丁膦耐受性	cry1Ab; bar
	棉	CE43-67B		昆虫抗性	cry1Ab
	棉	CE46-02A		昆虫抗性	cry1Ab
	棉	CE44-69D		昆虫抗性	cry1Ab
	棉	1143-14A		昆虫抗性	cry1Ab
	棉	1143-51B		昆虫抗性	cry1Ab
	棉	T342-142		昆虫抗性	cry1Ab
	棉	PV-GHGT07 (1445)		草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA : CP4)
	棉	EE-GH3		草甘膦耐受性	mepsps
	棉	EE-GH5		昆虫抗性	cry1Ab
	棉	MON88701	MON-88701-3	麦 草 畏 (Dicamba)和 草丁膦耐受性	修饰的 dmo; bar
	棉	OsCr11		抗过敏	修饰的 Cry j

[0733]	匍匐翦股颖 (Creeping Bentgrass)	ASR368	SMG-36800-2	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA : CP4)
	桉树	20-C		耐盐性	codA
	桉树	12-5C		耐盐性	codA
	桉树	12-5B		耐盐性	codA
	桉树	107-1		耐盐性	codA
	桉树		1/9/2001	耐盐性	codA
	桉树		2/1/2001	耐盐性	codA
	桉树			耐冷性	des9
	Flax	FP967	CDC-FL001-2	乙酰乳酸合成 酶除草剂耐受 性	als
	Lentil	RH44		咪唑啉酮类耐 受性	als
	玉蜀黍	3272	SYN-E3272-5	改性的 α -淀粉 酶	amy797E
	玉蜀黍	5307	SYN-05307-1	昆虫抗性	ecry3.1Ab
	玉蜀黍	59122	DAS-59122-7	昆虫抗性; 草 丁膦耐受性	cry34Ab1 ; cry35Ab1; pat
	玉蜀黍	676	PH-000676-7	草丁膦耐受 性; 授粉控制	pat; dam
	玉蜀黍	678	PH-000678-9	草丁膦耐受 性; 授粉控制	pat; dam
玉蜀黍	680	PH-000680-2	草丁膦耐受 性; 授粉控制	pat; dam	
玉蜀黍	98140	DP-098140-6	草甘膦耐受 性; 乙酰乳酸 合成酶除草剂 耐受性	gat4621; zm-hra	

	玉蜀黍	Bt10	NA	昆虫抗性; 草 丁腈耐受性	cry1Ab; pat
	玉蜀黍	Bt176 (176)	SYN-EV176-9	昆虫抗性; 草 丁腈耐受性	cry1Ab; bar
	玉蜀黍	BVLA430101	NA	植酸分解	phyA2
	玉蜀黍	CBH-351	ACS-ZM004-3	昆虫抗性; 草 丁腈耐受性	cry9C; bar
	玉蜀黍	DAS40278-9	DAS40278-9	2,4-D 耐受性	aad-1
	玉蜀黍	DBT418	DKB-89614-9	昆虫抗性; 草 丁腈耐受性	cry1Ac; pinII; bar
	玉蜀黍	DLL25 (B16)	DKB-89790-5	草丁腈耐受性	bar
	玉蜀黍	GA21	MON-00021-9	草甘膦耐受性	mepsps
	玉蜀黍	GG25		草甘膦耐受性	mepsps
	玉蜀黍	GJ11		草甘膦耐受性	mepsps
	玉蜀黍	FI117		草甘膦耐受性	mepsps
[0734]	玉蜀黍	GAT-ZM1		草丁腈耐受性	pat
	玉蜀黍	LY038	REN-00038-3	赖氨酸增加	cordapA
	玉蜀黍	MIR162	SYN-IR162-4	昆虫抗性	vip3Aa20
	玉蜀黍	MIR604	SYN-IR604-5	昆虫抗性	mcry3A
	玉蜀黍	MON801 (MON80100)	MON801	昆虫抗性; 草 甘膦耐受性	cry1Ab ; cp4 epsps (aroA : CP4); goxv247
	玉蜀黍	MON802	MON-80200-7	昆虫抗性; 草 甘膦耐受性	cry1Ab ; cp4 epsps (aroA : CP4); goxv247
	玉蜀黍	MON809	PH-MON-809-2	昆虫抗性; 草 甘膦耐受性	cry1Ab ; cp4 epsps (aroA : CP4); goxv247
	玉蜀黍	MON810	MON-00810-6	昆虫抗性; 草 甘膦耐受性	cry1Ab ; cp4 epsps (aroA :

	玉蜀黍	MON832	NA	草甘膦耐受性	CP4); goxv247 cp4 epsps (aroA : CP4); goxv247
	玉蜀黍	MON863	MON-00863-5	昆虫抗性	cry3Bb1
	玉蜀黍	MON87427	MON-87427-7	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA : CP4)
	玉蜀黍	MON87460	MON-87460-4	耐旱性	cspB
	玉蜀黍	MON88017	MON-88017-3	昆虫抗性; 草 甘膦耐受性	cry3Bb1 ; cp4 epsps (aroA : CP4)
	玉蜀黍	MON89034	MON-89034-3	昆虫抗性	cry2Ab2 ; cry1A.105
	玉蜀黍	MS3	ACS-ZM001-9	草丁膦耐受 性; 授粉控制	bar; barnase
	玉蜀黍	MS6	ACS-ZM005-4	草丁膦耐受 性; 授粉控制	bar; barnase
[0735]	玉蜀黍	NK603	MON-00603-6	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA : CP4)
	玉蜀黍	T14	ACS-ZM002-1	草丁膦耐受性	pat (syn)
	玉蜀黍	T25	ACS-ZM003-2	草丁膦耐受性	pat (syn)
	玉蜀黍	TC1507	DAS-01507-1	昆虫抗性; 草 丁膦耐受性	cry1Fa2; pat
	玉蜀黍	TC6275	DAS-06275-8	昆虫抗性; 草 丁膦耐受性	mocry1F; bar
	玉蜀黍	VIP1034		昆虫抗性; 草 丁膦耐受性	vip3A; pat
	玉蜀黍	43A47	DP-043A47-3	昆虫抗性; 草 丁膦耐受性	cry1F ; cry34Ab1 ; cry35Ab1; pat
	玉蜀黍	40416	DP-040416-8	昆虫抗性; 草	cry1F ;

[0736]	玉蜀黍	32316	DP-032316-8	丁腈耐受性 昆虫抗性; 草 丁腈耐受性	cry34Ab1 ; cry35Ab1; pat cry1F ; cry34Ab1 ; cry35Ab1; pat
	玉蜀黍	4114	DP-004114-3	昆虫抗性; 草 丁腈耐受性	cry1F ; cry34Ab1 ; cry35Ab1; pat
	甜瓜	甜瓜 A	NA	延迟成熟/衰 老	sam-k
	甜瓜	甜瓜 B	NA	延迟成熟/衰 老	sam-k
	木瓜	55-1	CUH-CP551-8	疾病抗性	prsv cp
	木瓜	63-1	CUH-CP631-7	疾病抗性	prsv cp
	木瓜	华农 1 号(Huanong No. 1)	NA	疾病抗性	prsv rep
	木瓜	X17-2	UFL-X17CP-6	疾病抗性	prsv cp
	矮牵牛花 (Petunia)	矮牵牛花-CHS	NA	改性产品质量	CHS 抑制
	李子 (Plum)	C-5	ARS-PLMC5-6	疾病抗性	ppv cp
	低芥酸菜籽**	ZSR500	NA	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA : CP4); goxv247
	低芥酸菜籽**	ZSR502	NA	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA : CP4); goxv247
	低芥酸菜籽**	ZSR503	NA	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA : CP4); goxv247
	杨树	Bt 杨树	NA	昆虫抗性	cry1Ac; API
	杨树	杨树杂交无性系 741	NA	昆虫抗性	cry1Ac; API
	杨树	trg300-1		高纤维素	AaXEG2

	杨树	trg300-2		高纤维素	AaXEG2
	马铃薯	1210 amk	NA	昆虫抗性	cry3A
	马铃薯	2904/1 kgs	NA	昆虫抗性	cry3A
	低芥酸菜籽**	ZSR500	NA	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA : CP4); goxv247
	低芥酸菜籽**	ZSR502	NA	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA : CP4); goxv247
	马铃薯	ATBT04-27	NMK-89367-8	昆虫抗性	cry3A
	马铃薯	ATBT04-30	NMK-89613-2	昆虫抗性	cry3A
	马铃薯	ATBT04-31	NMK-89170-9	昆虫抗性	cry3A
	马铃薯	ATBT04-36	NMK-89279-1	昆虫抗性	cry3A
	马铃薯	ATBT04-6	NMK-89761-6	昆虫抗性	cry3A
	马铃薯	BT06	NMK-89812-3	昆虫抗性	cry3A
	马铃薯	BT10	NMK-89175-5	昆虫抗性	cry3A
	马铃薯	BT12	NMK-89601-8	昆虫抗性	cry3A
[0737]	马铃薯	BT16	NMK-89167-6	昆虫抗性	cry3A
	马铃薯	BT17	NMK-89593-9	昆虫抗性	cry3A
	马铃薯	BT18	NMK-89906-7	昆虫抗性	cry3A
	马铃薯	BT23	NMK-89675-1	昆虫抗性	cry3A
	马铃薯	EH92-527-1	BPS-25271-9	改性的淀粉/ 碳水化合物	gbss (反义)
	马铃薯	HLMT15-15	NA	昆虫和疾病抗 性	cry3A; pvy cp
	马铃薯	HLMT15-3	NA	昆虫和疾病抗 性	cry3A; pvy cp
	马铃薯	HLMT15-46	NA	昆虫和疾病抗 性	cry3A; pvy cp
	马铃薯	RBMT15-101	NMK-89653-6	昆虫和疾病抗 性	cry3A; pvy cp
	马铃薯	RBMT21-129	NMK-89684-1	昆虫和疾病抗	cry3A; plrv orf1;

	马铃薯	RBMT21-152	NA	性 昆虫和疾病抗	plrv orf2 cry3A; plrv orf1;
	马铃薯	RBMT21-350	NMK-89185-6	性 昆虫和疾病抗	plrv orf2 cry3A; plrv orf1;
	马铃薯	RBMT22-082	NMK-89896-6	性 昆虫和疾病抗	plrv orf2 cry3A; plrv orf1;
				性; 草甘膦耐 受性	plrv orf2; cp4 epsps (aroA : CP4)
	马铃薯	RBMT22-186	NA	性 昆虫和疾病抗	plrv orf2; cp4 epsps (aroA : CP4)
	马铃薯	RBMT22-238	NA	性 昆虫和疾病抗	plrv orf2; cp4 epsps (aroA : CP4)
[0738]	马铃薯	RBMT22-262	NA	性 昆虫和疾病抗	plrv orf2; cp4 epsps (aroA : CP4)
	马铃薯	SEMT15-02	NMK-89935-9	性 昆虫和疾病抗	plrv orf2; cp4 epsps (aroA : CP4)
	马铃薯	SEMT15-07	NA	性 昆虫和疾病抗	plrv orf2; cp4 epsps (aroA : CP4)
	马铃薯	SEMT15-15	NMK-89930-4	性 昆虫和疾病抗	plrv orf2; cp4 epsps (aroA : CP4)
	马铃薯	SPBT02-5	NMK-89576-1	昆虫抗性	cry3A
	马铃薯	SPBT02-7	NMK-89724-5	昆虫抗性	cry3A
	稻	7Crp#242-95-7		抗过敏	7crp

	稻	7Crp#10	NA	抗过敏	7crp
	稻	遗传修饰的汕优 63 (GM Shanyou 63)	NA	昆虫抗性	cry1Ab; cry1Ac
	稻	华恢1号 (Huahui-1) /TT51-1	NA	昆虫抗性	cry1Ab; cry1Ac
	稻	LLRICE06	ACS-OS001-4	草丁膦耐受性	bar
	稻	LLRICE601	BCS-OS003-7	草丁膦耐受性	bar
	稻	LLRICE62	ACS-OS002-5	草丁膦耐受性	bar
	稻	Tarom molaii + cry1Ab	NA	昆虫抗性	cry1Ab (截短的)
	稻	GAT-OS2		草丁膦耐受性	bar
	稻	GAT-OS3		草丁膦耐受性	bar
	稻	PE-7		昆虫抗性	Cry1Ac
[0739]	稻	7Crp#10	NA	抗过敏	7crp
	稻	KPD627-8		高色氨酸	OASA1D
	稻	KPD722-4		高色氨酸	OASA1D
	稻	KA317		高色氨酸	OASA1D
	稻	HW5		高色氨酸	OASA1D
	稻	HW1		高色氨酸	OASA1D
	稻	B-4-1-18		直立叶型半矮 秆	Δ OsBRI1
	稻	G-3-3-22		半矮秆	OSGA2ox1
	稻	AD77		疾病抗性	DEF
	稻	AD51		疾病抗性	DEF
	稻	AD48		疾病抗性	DEF
	稻	AD41		疾病抗性	DEF
	稻	13pNasNaatAprt1		低铁耐受性	HvNAS1 ; HvNAAT-A ; APRT

	稻	13pAprt1		低铁耐受性	APRT
	稻	gHvNAS1-gHvNAAT-1		低铁耐受性	HvNAS1 ; HvNAAT-A ; HvNAAT-B
	稻	gHvIDS3-1		低铁耐受性	HvIDS3
	稻	gHvNAAT1		低铁耐受性	HvNAAT-A ; HvNAAT-B
	稻	gHvNAS1-1		低铁耐受性	HvNAS1
	稻	NIA-OS006-4		疾病抗性	WRKY45
	稻	NIA-OS005-3		疾病抗性	WRKY45
	稻	NIA-OS004-2		疾病抗性	WRKY45
	稻	NIA-OS003-1		疾病抗性	WRKY45
	稻	NIA-OS002-9		疾病抗性	WRKY45
	稻	NIA-OS001-8		疾病抗性	WRKY45
	稻	OsCr11		抗过敏	修饰的 Cry j
[0740]	稻	17053		草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA : CP4)
	稻	17314		草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA : CP4)
	玫瑰	WKS82/130-4-1	IFD-52401-4	改变的花色	5AT ; bp40 (f3'5'h)
	玫瑰	WKS92/130-9-1	IFD-52901-9	改变的花色	5AT ; bp40 (f3'5'h)
	大豆	260-05 (G94-1, G94-19, G168)	NA	改性的油/脂 肪酸	gm-fad2-1 (沉默 位点)
	大豆	A2704-12	ACS-GM005-3	草丁膦耐受性	pat
	大豆	A2704-21	ACS-GM004-2	草丁膦耐受性	pat
	大豆	A5547-127	ACS-GM006-4	草丁膦耐受性	pat
	大豆	A5547-35	ACS-GM008-6	草丁膦耐受性	pat
	大豆	CV127	BPS-CV127-9	咪唑啉酮类耐	csr1-2

[0741]	大豆	DAS68416-4	DAS68416-4	受性	
	大豆	DP305423	DP-305423-1	草丁膦耐受性	pat
	大豆	DP356043	DP-356043-5	改性的油/脂肪酸; 乙酰乳酸合成酶除草剂耐受性	gm-fad2-1 (沉默位点); gm-hra
	大豆	FG72	MST-FG072-3	改性的油/脂肪酸; 草甘膦耐受性	gm-fad2-1 (沉默位点); gat4601
	大豆	GTS 40-3-2 (40-3-2)	MON-04032-6	草甘膦和 HPPD 耐受性	2mepsps; hppdPF W336
	大豆	GU262	ACS-GM003-1	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA: CP4)
	大豆	MON87701	MON-87701-2	昆虫抗性	pat
	大豆	MON87705	MON-87705-6	改性的油/脂肪酸; 草甘膦耐受性	cry1Ac
	大豆	MON87708	MON-87708-9	改性的油/脂肪酸; 草甘膦耐受性	fatb1-A (有义和反义); fad2-1A (有义和反义); cp4 epsps (aroA: CP4)
	大豆	MON87769	MON-87769-7	麦草畏和草甘膦耐受性	dmo; cp4 epsps (aroA: CP4)
	大豆	MON89788	MON-89788-1	改性的油/脂肪酸; 草甘膦耐受性	Pj.D6D ; Nc.Fad3 ; cp4 epsps (aroA: CP4)
	大豆	W62	ACS-GM002-9	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA: CP4)
	大豆	W98	ACS-GM001-8	草丁膦耐受性	bar

[0742]	大豆	MON87754	MON-87754-1	高油	dgat2A
	大豆	DAS21606	DAS-21606	芳氧基链烷酸酯 (Aryloxyalkanoate) 和草丁磷耐受性	修饰的 aad-12; pat
	大豆	DAS44406	DAS-44406-6	芳氧基链烷酸酯、草甘膦和草丁磷耐受性	修饰的 aad-12; 2mepsps; pat
	大豆	SYHT04R	SYN-0004R-8	硝磺草酮 (Mesotrione) 耐受性	修饰的 avhppd
	大豆	9582.814.19.1		昆虫抗性和草丁磷耐受性	cry1Ac, cry1F, PAT
	南瓜	CZW3	SEM-ØCZW3-2	疾病抗性	cmv cp, zymv cp, wmv cp
	南瓜	ZW20	SEM-ØZW20-7	疾病抗性	zymv cp, wmv cp
	甜菜	GTSB77 (T9100152)	SY-GTSB77-8	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA: CP4); goxv247
	甜菜	H7-1	KM-000H71-4	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA: CP4)
	甜菜	T120-7	ACS-BV001-3	草丁磷耐受性	pat
	甜菜	T227-1		草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA: CP4)
	甘蔗	NXI-1T		耐旱性	EcbetA
	向日葵	X81359		咪唑啉酮类耐受性	als
	甜椒	PK-SP01	NA	疾病抗性	cmv cp
烟草	C/F/93/08-02	NA	苯腈类耐受性	bxn	

[0743]	烟草	Vector 21-41	NA	降低的尼古丁	NtQPT1 (反义)
	番茄	1345-4	NA	延迟成熟/衰老	acc (截短的)
	番茄	35-1-N	NA	延迟成熟/衰老	sam-k
	番茄	5345	NA	昆虫抗性	cry1Ac
	番茄	8338	CGN-89322-3	延迟成熟/衰老	accd
	番茄	B	SYN-0000B-6	延迟成熟/衰老	pg (有义或反义)
	番茄	Da	SYN-0000DA-9	延迟成熟/衰老	pg (有义或反义)
	向日葵	X81359		咪唑啉酮类耐受性	als
	番茄	大东 9 号 (Da Dong No 9)	NA	改性产品	NA
	番茄	F (1401F, h38F, 11013F, 7913F)	SYN-0000F-1	延迟成熟/衰老	pg (有义或反义)
	番茄	FLAVR SAVR™	CGN-89564-2	延迟成熟/衰老	pg (有义或反义)
	番茄	华番 1 号 (Huafan No 1)	NA	延迟成熟/衰老	抗 efe
	番茄	PK-TM8805R (8805R)	NA	疾病抗性	cmv cp
	小麦	MON71800	MON-71800-3	草甘膦耐受性	cp4 epsps (aroA: CP4)

[0744] *阿根廷,**波兰,#茄子

[0745] 用本披露的化合物处理经遗传修饰的植株和种子可导致增强的效应。例如,降低施用量、拓展活性谱、增加对生物/非生物胁迫的耐受性或增强储存稳定性可大于来自仅简单在经基因修饰的植物和种子上施用本披露的化合物的加性效应所预期的。

[0746] 本披露的化合物还可用于种子处理剂中以保护种子免受无脊椎有害生物。在本披露和权利要求书的上下文中,处理种子意指使种子与生物学有效量的通常被配制成成本披露

的组合物的本披露的化合物接触。该种子处理剂保护种子免受无脊椎土壤有害生物的危害并且总体上还可以保护由发芽种子发育成的幼苗的根和其他与土壤接触的植株部位。该种子处理剂还可以通过使本披露的化合物或第二活性成分在发育中的植物中易位来向叶子提供保护。可向所有类型的种子施用种子处理,包括将发芽形成遗传转化以表达特定性状的植株的那些种子。代表性实例包括表达对无脊椎有害生物有毒的蛋白质的那些,诸如苏云金芽孢杆菌毒素,或表达抗除草剂性的那些,诸如提供草甘膦抗性的草甘膦乙酰转移酶。使用本披露的化合物的种子处理还可增加由经处理的种子生长出的植株的活力。

[0747] 种子处理的一种方法是在播撒种子之前,通过用本披露的化合物(即作为配制的组合物)对种子喷雾或撒粉。经配制用于种子处理的组合物通常包含成膜剂或粘合剂。因此,典型地本披露的种子包衣组合物包含生物学有效量的式1的化合物、其N-氧化物或盐以及成膜剂或粘合剂。可通过将可流动的悬浮液浓缩物直接喷雾到种子的翻滚床中并且然后干燥种子来为种子包衣。替代地,可将其他制剂类型诸如湿粉、溶液、悬浮乳液、可乳化的浓缩物和水中的乳液喷雾在种子上。该方法特别可用于将膜包衣施用在种子上。本领域技术人员可使用各种包衣机器和方法。合适的方法包括在P.Kosters等人,Seed Treatment: Progress and Prospects[种子处理:进展与前景],1994BCPC专著号57以及其中列出的参考文献中列出的那些方法。

[0748] 式1的化合物和它们的组合物,单独地或者与其他杀昆虫剂和杀真菌剂组合,特别可用于对作物的种子处理,这些作物包括但不限于玉蜀黍或玉米、大豆、棉、谷类(例如,小麦、燕麦、大麦、黑麦和稻)、马铃薯、蔬菜和油菜。

[0749] 可与式1的化合物一起配制以提供可用于种子处理的混合物的其他杀昆虫剂包括阿巴汀、啶虫脒、氟丙菊酯、双甲脒、阿维菌素、印楝素、杀虫磺、联苯菊酯、噻嗪酮、甲萘威、克百威、杀螟丹、氯虫苯甲酰胺、溴虫腈、毒死蜱、噻虫胺、溴氰虫酰胺、氟氯氰菊酯、高效氟氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯、精高效氯氟氰菊酯、高效氯氟氰菊酯、氯氰菊酯、顺式氯氰菊酯、 ζ -氯氰菊酯、灭蝇胺、溴氰菊酯、狄氏剂、呋虫胺、苯虫醚、甲氨基阿维菌素、硫丹、高氰戊菊酯、乙虫腈、醚菊酯、乙螨唑、苯硫威、苯氧威、氰戊菊酯、氟虫腈、氟啶虫酰胺、氟虫双酰胺、氟虫脲、氟胺氰菊酯、伐虫脒、噻唑膦、氟铃脲、氟蚁腯、吡虫啉、茚虫威、虱螨脲、氰氟虫腯、甲硫威、灭多威、烯虫酯、甲氧虫酰胺、烯啶虫胺、硝虫噻嗪、氟酰胺、杀线威、吡蚜酮、除虫菊素、哒螨灵、啶虫丙醚、吡丙醚、兰尼碱、乙基多杀菌素、多杀菌素、螺螨酯、螺甲螨酯、螺虫乙酯、氟啶虫胺腈、虫酰胺、胺菊酯、噻虫啉、噻虫嗪、硫双威、杀虫双、四溴菊酯、啞蚜威、杀铃脲、苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素、苏云金芽孢杆菌的所有菌株和核型多角体病毒的所有毒株。

[0750] 可与式1的化合物一起配制以提供可用于种子处理的混合物的杀真菌剂包括吡啶磺菌胺、嘧菌酯、啶酰菌胺、多菌灵、萎锈灵、霜脲氰、环唑醇、苯醚甲环唑、烯酰吗啉、氟啶胺、咯菌腈、氟唑啉、氟吡菌胺、氟嘧菌酯、粉唑醇、氟唑菌酰胺、种菌唑、异菌脲、甲霜灵、精甲霜灵、叶菌唑、腈菌唑、多效唑、氟唑菌苯胺、啶氧菌酯、丙硫菌唑、唑菌胺酯、氟唑环菌胺、硅噻菌胺、戊唑醇、噻苯达唑、甲基托布津、塞仑、肟菌酯和灭菌唑。

[0751] 可用于种子处理的包含式1的化合物的组合物可进一步包含细菌,诸如短小芽孢杆菌(例如,菌株GB34)和坚强芽孢杆菌(例如,分离物1582)、根瘤菌接种剂/增殖剂、异黄酮和脂壳寡糖。

[0752] 经处理的种子通常包含本披露的化合物,该化合物的量是约0.1g至1kg/100kg种

子(即处理前种子的约0.0001重量%至1重量%)。经配制用于种子处理的可流动的悬浮液通常包含从约0.5%至约70%的活性成分、从约0.5%至约30%的成膜粘合剂、从约0.5%至约20%的分散剂、从0%至约5%的增稠剂、从0%至约5%的颜料和/或染料、从0%至约2%的消泡剂、从0至约1%的防腐剂、以及从0%至约75%的挥发性液体稀释剂。

[0753] 本披露的化合物可被结合到饵料组合物中,该饵料组合物被无脊椎有害生物食用或用于装置诸如诱捕器、饵料站等中。此种诱饵组合物可呈颗粒剂的形式,该颗粒剂包含(a)活性成分,即生物学有效量的式1的化合物、其N-氧化物或盐;(b)一种或多种食物材料;任选地(c)引诱剂,和任选地(d)一种或多种湿润剂。值得注意的是颗粒或饵料组合物,其包含在约0.001%-5%之间的活性成分、约40%-99%的食物材料和/或引诱剂;以及任选地约0.05%-10%的湿润剂,其可在非常低的施用量下,特别是通过摄取而不是通过直接接触时致命的活性成分剂量下,有效防治土壤无脊椎有害生物。一些食物材料可用作食物来源和引诱剂二者。食物材料包括碳水化合物、蛋白质和脂质。食物材料的实例是蔬菜粉、糖、淀粉、动物脂肪、植物油、酵母提取物和乳固体。引诱剂的实例是增味剂和风味剂,诸如水果或植物提取物、香料、或其他动物或植物组分、信息素或已知用于吸引目标无脊椎有害生物的其他剂。湿润剂(即保水剂)的实例是乙二醇和其他多元醇、甘油和山梨醇。值得注意的是用于防治至少一种选自由蚂蚁、白蚁和蟑螂组成的组的无脊椎有害生物的饵料组合物(以及使用此种饵料组合物的方法)。一种用于防治无脊椎有害生物的装置可包含本发明的诱饵组合物和被适配成容纳诱饵组合物的外壳,其中外壳具有至少一个开口,其尺寸设定成允许无脊椎有害生物通过开口,使无脊椎有害生物能够从外壳以外的位置接近诱饵组合物,并且其中外壳进一步被适配成放置在无脊椎有害生物可能或已知的活动场所中或附近。

[0754] 可在没有其他辅助剂的情况下施用本披露的化合物,但是最常见的施用是施用制剂,该制剂包含一种或多种具有合适的载体、稀释剂和表面活性剂的活性成分,并且根据所设想的最终用途有可能与食物组合。一种施用方法涉及将本披露的化合物的水分散体或精炼油溶液喷雾。与喷雾油、喷雾油浓缩液、粘展剂、辅助剂、其他溶剂和胡椒基丁醚的组合通常增强化合物功效。对于非农学用途,此类喷雾可从喷雾容器诸如罐、瓶或其他容器中,借助于泵或通过将其从加压容器例如加压气溶胶喷雾罐中释放出来施用。此类喷雾组合物可采取多种形式,例如喷雾、薄雾、泡沫、烟雾或尘雾。因此,根据具体情况,此类喷雾组合物可进一步包含推进剂、发泡剂等。值得注意的是包含生物学有效量的本披露的化合物或组合物以及载体的喷雾组合物。此种喷雾组合物的一个实施例包含生物学有效量的本披露的化合物或组合物以及推进剂。代表性推进剂包括但不限于甲烷、乙烷、丙烷、丁烷、异丁烷、丁烯、戊烷、异戊烷、新戊烷、戊烯、氢氟烃、氯氟烃、二甲醚和前述的混合物。值得注意的是用于防治至少一种无脊椎有害生物的喷雾组合物(和使用由喷雾容器分配的此种喷雾组合物的方法),该至少一种无脊椎有害生物选自由以下组成的组:蚊子、蚋、厩螫蝇、鹿虻、马蝇、胡蜂、小黄蜂、大黄蜂、蜜蜂、蜘蛛、蚂蚁、螻蛄等,包括单独地或以组合。

[0755] 本披露的一个实施例涉及一种用于防治无脊椎有害生物的方法,该方法包括用水稀释本披露的杀有害生物组合物(与表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂一起配制的式1的化合物,或式1的化合物和至少一种其他杀有害生物剂的配制的混合物),以及任选地添加辅助剂以形成稀释的组合物,以及使无脊椎有害生物或其环境与有效量的所述稀释的组合物接触。

[0756] 尽管通过用水稀释足够浓度的本发明的杀有害生物组合物形成的喷雾组合物可提供充分的防治无脊椎有害生物的功效,但单独配制的辅助剂产品也可被添加到喷雾槽混合物中。这些附加的辅助剂通常被称为“喷雾辅助剂”或“槽-混合辅助剂”,并且包含混合在喷雾槽中以改善杀有害生物剂的性能或改变喷雾混合物的物理特性的任何物质。辅助剂可以是表面活性剂、乳化剂、基于石油的作物油、作物衍生的种子油、酸化剂、缓冲液、增稠剂或消泡剂。辅助剂被用于增强功效(例如,生物利用度、粘附性、渗透性、覆盖均匀度和保护耐久性),或最小化或消除与不相容性、发泡、飘移、蒸发、挥发和降解相关联的喷雾应用问题。为了获得最佳性能,关于活性成分的特性、制剂和目标(例如,作物、昆虫有害生物)来选择辅助剂。

[0757] 在喷雾辅助剂之中,最通常使用油(包括作物油、作物油浓缩物、植物油浓缩物和甲基化种子油浓缩物)来改善杀有害生物剂的功效,这可能是通过促进更均匀且一致的喷雾沉积来实现的。在其中可能由油或其他与水不混溶的液体引起的植物毒性是重要的情况下,由本披露的组合物制备的喷雾组合物通常将不含油基喷雾辅助剂。然而,在其中由油基喷雾辅助剂造成的植物毒性在商业上不重要的情况下,由本发明组合物的组合物制备的喷雾组合物也可含有油基喷雾辅助剂,这可潜在地进一步增加对无脊椎有害生物的防治、以及耐雨性。

[0758] 确定为“作物油”的产品典型地含有95%至98%的石蜡或石脑油基石油和1%至2%的一种或多种用作乳化剂表面活性剂。确定为“作物油浓缩物”的产品通常由80%至85%的可乳化石油基油和15%至20%的非离子表面活性剂组成。正确地确定为“植物油浓缩物”的产品通常由80%至85%的植物油(即种子油或果实油,最通常来自棉花、亚麻籽、大豆或向日葵)和15%至20%的非离子表面活性剂组成。可通过用通常衍生自植物油的脂肪酸的甲酯替代植物油来改善辅助剂性能。甲基化种子油浓缩物的实例包括MSO[®]浓缩物(UAP-Loveland产品公司(UAP-Loveland Products, Inc.))和Premium MSO甲基化喷雾油(海伦娜化学公司(Helena Chemical Company))。

[0759] 添加到喷雾混合物中的辅助剂的量通常不超过按体积计约2.5%,并且更通常地该量为按体积计从约0.1%至约1%。添加到喷雾混合物中的辅助剂的施用量通常在每公顷约1L至5L之间。喷雾辅助剂的代表性实例包括:Adigor[®](先正达公司(Syngenta))液烃中的47%甲基化菜籽油、Silwet[®](海伦娜化学公司(Helena Chemical Company))聚醚改性的七甲基三硅氧烷以及Assist[®](巴斯夫公司(BASF))83%石蜡基矿物油中的17%表面活性剂共混物。

[0760] 非农学应用包括通过向待保护动物(特别是脊椎动物,更特别地恒温脊椎动物(例如,哺乳动物或鸟类)并且最特别地哺乳动物)施用杀寄生虫有效(即生物学有效)量的本披露化合物(典型地呈被配制用于兽医用途的组合物的形式)来保护动物免受无脊椎寄生性有害生物的危害。因此,值得注意的是用于保护动物的方法,该方法包括向动物施用杀寄生虫有效量的本披露的化合物。如在本披露和权利要求中所提及,术语“杀寄生虫的”和“杀寄生虫地”是指对无脊椎寄生性有害生物的可观察影响,以保护动物免受有害生物的危害。杀寄生虫效果典型地与减少目标无脊椎寄生性有害生物的出现或活动有关。此类对有害生物的影响包括坏死、死亡、生长迟缓、移动性降低或留在宿主动物身上或体内的能力降低、取

食减少和生殖抑制。这些对无脊椎寄生性有害生物的影响防治(包括预防、减少或消除)动物的寄生虫侵害或感染。通过向待保护动物施用杀寄生虫有效量的本披露的化合物来防治的无脊椎寄生性有害生物的实例包括体表寄生虫(节肢动物、螨类(acarines)等)和体内寄生虫(蠕虫,例如线虫、吸虫、绦虫、棘头动物等)。特别地,本披露的化合物对包括以下的体表寄生虫有效:蝇,诸如角蝇(*Haematobia (Lyperosia) irritans*)、厩螫蝇(*Stomoxys calcitrans*)、蚋(蚋属(*Simulium*)物种)、采采蝇(舌蝇属(*Glossina*)物种)、头蝇(*Hydrotaea irritans*)、秋家蝇(*Musca autumnalis*)、家蝇(*Musca domestica*)、简莫蝇(*Morellia simplex*)、马蝇(虻属物种)、牛皮蝇(*Hypoderma bovis*)、纹皮蝇(*Hypoderma lineatum*)、丝光绿蝇(*Lucilia sericata*)、绿头苍蝇(*Lucilia cuprina*)、丽蝇(丽蝇属(*Calliphora*)物种)、原伏蝇属(*Protophormia*)物种、羊狂蝇(*Oestrus ovis*)、蠓(库蠓属(*Culicoides*)物种)、马虱蝇(*Hippobosca equine*)、肠胃蝇(*Gastrophilus instestinalis*)、赤马胃蝇(*Gastrophilus haemorrhoidalis*)和鼻胃蝇(*Gastrophilus nasalis*);虱,诸如牛毛虱(*Bovicola (Damalinia) bovis*)、马毛虱(*Bovicola equi*)、驴血虱(*Haematopinus asini*)、猫毛虱(*Felicola subrostratus*)、袋鼠虱(*Heterodoxus spiniger*)、棘颚虱(*Lignonathus setosus*)和犬毛虱(*Trichodectes canis*);羊蜱蝇,诸如绵羊虱蝇;螨,诸如痒螨属(*Psoroptes*)物种、人疥螨(*Sarcoptes scabiei*)、牛皮痒螨(*Chorioptes bovis*)、马蠕形螨(*Demodex equi*)、姬螫螨属(*Cheyletiella*)物种、背肛螨(*Notoedres cati*)、恙螨属(*Trombicula*)物种和耳螨(*Otodectes cyanotis*);蜱,诸如硬蜱属(*Ixodes*)物种、牛蜱属(*Boophilus*)物种、扇头蜱属(*Rhipicephalus*)物种、花蜱属(*Amblyomma*)物种、革蜱属(*Dermacentor*)物种、璃眼蜱属(*Hyalomma*)物种和血蜱属(*Haemaphysalis*)物种;和跳蚤,诸如猫蚤(*Ctenocephalides felis*)和犬蚤(*Ctenocephalides canis*)。

[0761] 兽医部门中的非农学应用是通过常规手段,诸如以例如片剂、胶囊、饮料、浸液制品、颗粒剂、糊剂、大丸药、喂入程序或栓剂的形式肠道内施用;或诸如通过注射(包括肌肉注射、皮下注射、静脉内注射、腹膜内注射)或植入物的肠胃外施用;鼻腔施用;例如以浸泡或浸渍、喷雾、洗涤、粉末涂层、或施加于动物的一小块区域和通过包含本披露的化合物或组合物的物品(诸如颈圈、耳标、尾带、肢带或缰绳)的形式局部施用。

[0762] 典型地,根据本披露的杀寄生虫组合物包含式1的化合物、其N-氧化物或盐与一种或多种药学上或兽医学上可接受的载体的混合物,该一种或多种药学上或兽医学上可接受的载体包含关于预期施用途径(例如,口服、局部或肠胃外施用,诸如注射)并且根据标准操作选择的赋形剂和助剂。另外,基于与组合物中的一种或多种活性成分的相容性选择合适的载体,包括诸如相对于pH和水分含量的稳定性的考虑。因此,值得注意的是用于保护动物免受无脊椎寄生性有害生物侵害的组合物,该组合物包含杀寄生虫有效量的本披露的化合物和至少一种载体。

[0763] 对于包括静脉内注射、肌肉注射和皮下注射的肠胃外施用,本披露的化合物可在油性或水性媒介物中以悬浮液、溶液或乳液的形式配制,并且可含有诸如悬浮剂、稳定剂和/或分散剂的辅助剂。用于注射的药物组合物包括水溶性形式的活性成分(例如,活性化合物的盐)的水性溶液,优选在含有其他赋形剂或助剂的生理相容性缓冲液中,如药物制剂领域中已知的。

[0764] 对于以溶液(最容易获得的吸收形式)、乳液、悬浮液、糊剂、凝胶、胶囊、片剂、大丸药、粉末、颗粒剂、瘤胃滞留和饲料/水/舔块的形式口服施用,本披露的化合物可以与本领域已知的适用于口服施用组合物的粘合剂/填料一起配制,诸如糖(例如,乳糖、蔗糖、甘露醇、山梨糖醇)、淀粉(例如,玉蜀黍淀粉、小麦淀粉、稻米淀粉、马铃薯淀粉)、纤维素和衍生物(例如,甲基纤维素、羧甲基纤维素、乙基羟基纤维素)、蛋白质衍生物(例如,玉米醇溶蛋白(zein)、明胶)和合成聚合物(例如,聚乙烯醇、聚乙烯吡咯烷酮)。如果需要,可以添加润滑剂(例如硬脂酸镁)、崩解剂(例如,交联聚乙烯吡咯烷酮、琼脂、褐藻酸)和染料或颜料。糊剂和凝胶通常还含有粘合剂(例如,阿拉伯胶、褐藻酸、膨润土、纤维素、黄原胶、胶体硅酸镁铝),以帮助保持组合物与口腔接触而不易被排出。

[0765] 如果杀寄生虫组合物呈饲料浓缩物的形式,则载体典型地选自高性能饲料、饲料谷物或蛋白质浓缩物。除了杀寄生虫活性成分之外,此类含有饲料浓缩物的组合物还可以包含促进动物健康或生长、改善屠宰用动物肉质量或以其他方式对动物饲养有用的添加剂。这些添加剂可包括例如维生素、抗生素、化学疗法、抑菌剂、抑真菌剂、抗球虫剂和激素。

[0766] 已发现本披露化合物具有良好的药代动力学和药效学特性,从而通过口服施用和摄取提供全身可用性。因此,在待保护的动物摄取后,血流中杀寄生虫有效浓度的本披露化合物保护经处理的动物免受吸血有害生物(诸如跳蚤、蜱虫和虱)的侵害。因此,值得注意的是用于保护动物免受无脊椎寄生性有害生物侵害的呈用于口服施用的形式的组合物(即,除了杀寄生虫有效量的本披露的化合物外,还包含一种或多种选自适用于口服施用的粘合剂和填料的载体以及饲料浓缩物载体)。

[0767] 用于局部施用的制剂典型地呈粉末、乳膏、悬浮液、喷雾、乳液、泡沫、糊剂、气溶胶、软膏、药膏或凝胶的形式。更典型地,局部制剂是水溶性溶液,其可以呈浓缩物的形式,在使用前稀释。适用于局部施用的杀寄生虫组合物典型地包含本披露的化合物和一种或多种局部合适的载体。在将杀寄生虫组合物作为线或点(即“点样”处理)局部施加至动物的外部时,活性成分迁移到动物的表面以覆盖其大部分或全部外表面区域。因此,经处理的动物特别地被保护免受以动物表皮为食的无脊椎有害生物(诸如蜱虫、跳蚤和虱)的侵害。因此,用于局部施用的制剂通常包含至少一种有机溶剂,以促进活性成分在动物皮肤上的运输和/或渗透到动物表皮内。在此类制剂中通常用作载体的溶剂包括丙二醇、石蜡、芳族化合物、酯(诸如肉豆蔻酸异丙酯)、乙二醇醚和醇(诸如乙醇和正丙醇)。

[0768] 有效防治所需的施用率(即“生物学有效量”)将取决于诸如以下的因素:待防治的无脊椎动物种类、有害生物的生命周期、生命阶段、其大小、位置、一年中的时间、寄主作物或动物、取食行为、交配行为、环境湿度、温度。在正常情况下,每公顷约0.01kg至2kg活性成分的施用量足以在农业生态系统中防治有害生物,但是低至0.0001kg/公顷可能就足够,或可能需要高达8kg/公顷。对于非农学应用,有效的使用量将在约1.0mg/平方米至50mg/平方米之间,但是低至0.1mg/平方米可能就足够,或可能需要高达150mg/平方米。本领域技术人员可以容易地确定希望的无脊椎有害生物防治水平所需的生物学有效量。

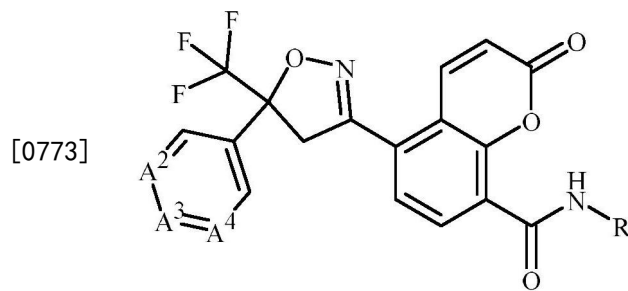
[0769] 通常对于兽医用途,将式1的化合物、其N-氧化物或盐以杀寄生虫有效量施用对待保护以免受无脊椎寄生性有害生物侵害的动物。杀寄生虫有效量是达到可观察效果(减少目标无脊椎寄生性有害生物的出现或活动)所需的活性成分的量。本领域技术人员将理解,杀寄生虫有效剂量可因本披露的各种化合物和组合物、期望的杀寄生虫效果和持续时间、

目标无脊椎有害生物种类、待保护的动物、施加模式等而变化,并且实现特定结果所需的量可以通过简单的实验来确定。

[0770] 对于恒温动物的口服施用,本披露的化合物的日剂量典型地为动物体重的从约0.01mg/kg至约100mg/kg,更典型地从约0.5mg/kg至约100mg/kg。对于局部(例如,表皮)施用,浸渍液和喷雾典型地含有从约0.5ppm至约5000ppm,更典型地从约1ppm至约3000ppm的本披露化合物。

[0771] 通过本文描述的方法制备的本披露的化合物在索引表A中示出。对于质谱(MS)数据,报告的数值是通过使用大气压化学电离(AP⁺)的质谱法观察到的通过H⁺(分子量为1)加在分子上形成的最高同位素丰度母离子(M+1)的分子量。以下缩写用于随后的索引表中: Cmpd意指化合物, i-Pr是异丙基, Bu是丁基, c-Pr是环丙基。缩写“Ex.”代表“实例”并且后面是数字,该数字表示化合物在哪个合成实例中制备。

[0772] 索引表A



[0774] 化合物编号	A ²	A ³	A ⁴	R	熔点(°C)
1	C-Cl	C-F	C-Cl	c-Pr	209.6 -214.6

[0775] 以下测试证明了本披露的化合物对特定有害生物的防治功效。“防治功效”表示导致取食显著降低的对无脊椎有害生物的发育的抑制(包括死亡率)。然而,由化合物提供的有害生物防治保护不限于这些种类。化合物描述参见索引表A。

[0776] 生物学实例

[0777] 用于测试A-C的配制和喷雾方法学

[0778] 使用含有10%丙酮、90%水和300ppm Activator 90[®]非离子表面活性剂(美国科罗拉多州洛弗兰德的洛弗兰德产品公司(Loveland Products, Loveland, Colorado, USA))的溶液来配制测试化合物。配制的化合物通过定位在每个测试单元的顶部上方1.27cm(0.5英寸)的雾化喷嘴以1mL的液体施加。测试化合物以指定的速率进行喷雾,并且每次测试重复三次。

[0779] 测试A

[0780] 为了评估对小菜蛾的防治,测试单元由内部具有12至14天龄芥子植株的小开口容器组成。这是用约50只初孵幼虫预侵害的,使用接种剂经由玉米棒屑将这些幼虫分配到测试单元中。分配到测试单元中之后,将幼虫移到测试植株上。

[0781] 配制测试化合物,并以2ppm和0.4ppm进行喷雾。在将配制的测试化合物进行喷雾后,使每个测试单元干燥1小时,并且然后将黑色遮蔽盖放置在顶部上。将测试单元在25°C和70%相对湿度的生长室中保持6天。然后根据消耗的叶子在视觉上评估植物取食损害,并且评估幼虫的死亡率。

[0782] 在0.4ppm下测试的式1的化合物中,以下提供了非常好至优异水平的防治功效(40%或更少的取食损害和/或100%死亡率):1.

[0783] 测试B

[0784] 为了评估对秋粘虫(草地贪夜蛾)的防治,测试单元由内部具有4至5天龄玉米(玉蜀黍)植株的小开口容器组成。这是用一片昆虫饲料上10至15天龄幼虫预侵害的。

[0785] 配制测试化合物,并以2ppm和0.4ppm进行喷雾。将配制的测试化合物进行喷雾后,将测试单元维持在25℃和70%相对湿度的生长室中6天。然后根据消耗的叶子在视觉上评估植物取食损害,并且评估幼虫的死亡率。

[0786] 在2ppm下测试的式1的化合物中,以下提供了非常好至优异水平的防治功效(40%或更少的取食损害和/或100%死亡率):1.

[0787] 测试C

[0788] 为了通过接触和/或内吸手段评估对西花蓟马的防治,测试单元由内部具有5至7天龄Soleil豆植株的小开口容器组成。

[0789] 配制测试化合物,并以2ppm、0.4ppm、和0.08ppm进行喷雾。喷雾后,使测试单元干燥1小时,并且然后向每个单元中添加约60只蓟马(成虫和若虫)。将黑色遮蔽盖放置在顶部上,并且将测试单元在25℃和45%-55%相对湿度下保持6天。然后在视觉上评估每个测试单元的植株损害和昆虫死亡率。

[0790] 在2ppm下所测试的式1的化合物中,以下提供了非常好至优异的防治功效水平(30%或更小的植株损害和/或100%死亡率):1.