



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 118745174 A

(43) 申请公布日 2024.10.08

(21) 申请号 202410735234.4

(22) 申请日 2019.01.10

(30) 优先权数据

18161197.1 2018.03.12 EP

201811001665 2018.01.15 IN

(62) 分案原申请数据

201980018362.4 2019.01.10

(71) 申请人 先正达参股股份有限公司

地址 瑞士

(72) 发明人 P·J·M·容 A·埃德蒙兹

D·埃默里 M·米尔巴赫

S·伦德勒 A·布驰赫尔兹

G·拉瓦尔 I·森 V·斯科瓦尔

(74) 专利代理机构 中国贸促会专利商标事务所  
有限公司 11038

专利代理师 张敏

(51) Int.Cl.

C07D 471/04 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

A01P 7/02 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

A01P 5/00 (2006.01)

A01P 9/00 (2006.01)

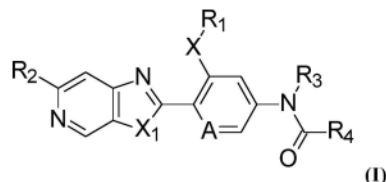
权利要求书8页 说明书107页

(54) 发明名称

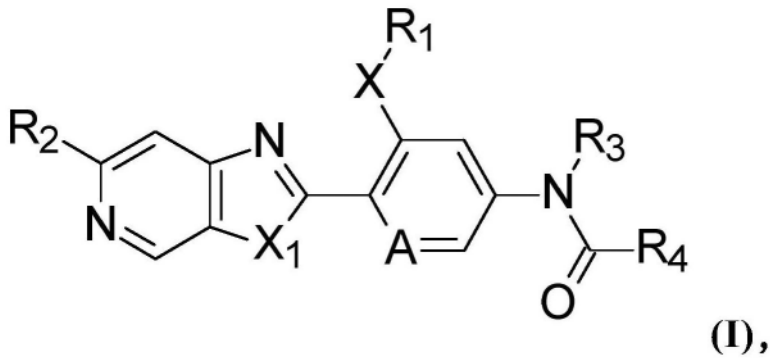
具有含硫取代基的杀有害生物活性的杂环  
衍生物

(57) 摘要

披露了具有式 (I) 的化合物,其中取代基是如权利要求1中所定义的。此外,本发明涉及包含具有式 (I) 的化合物的农用化学组合物、涉及这些组合物的制备、并且涉及所述化合物或组合物 10 在农业或园艺中用于对抗、预防或控制动物有害生物用途,所述动物有害生物包括节肢动物并且特别是昆虫或蜱螨目的代表。



1. 一种具有式 (I) 的化合物



其中

A是CH或N;

X是S、SO或SO<sub>2</sub>;

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

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

R<sub>3</sub>是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>氰基烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>羟基烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷硫基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>卤代环烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基或被选自以下的取代基取代的C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基: 氰基、卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基、CO<sub>2</sub>H、CONH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>二烷基氨基羰基或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基羰基;

R<sub>4</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>羟基烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷硫基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>氰基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基或被选自以下组成的组的取代基单取代或多取代的C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基: 卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基、CO<sub>2</sub>H、CONH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>二烷基氨基羰基和C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基羰基;或

R<sub>4</sub>是可以部分饱和或完全饱和的四至六元杂环体系,所述环体系含有1至2个选自O、N、或S(O)<sub>n</sub>的环杂原子,其中n是0、1或2,其前提是所述杂环体系不含有相邻的氧原子、相邻的硫原子或相邻的硫和氧原子,并且所述环氮,当存在时,可以被氢或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基取代,并且所述环体系可以任选地来自以下组成的组单取代或二取代: 卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基或氧代基;或

R<sub>3</sub>和R<sub>4</sub>与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成5或6元饱和的五或六元环体系,所述环体系可以含有一或两个选自O、N、或S(O)<sub>n</sub>的额外的环杂原子,其中n是0、1或2,其前提是所述杂环体系不含有相邻的氧原子、相邻的硫原子或相邻的硫和氧原子,并且所述额外的环氮,当存在时,被氢或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基取代,并且其中所述环体系可以任选地被独立地选自以下的取代基单取代或二取代: 卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基或氧代基;并且

X<sub>1</sub>是O、S或NR<sub>5</sub>;其中R<sub>5</sub>是氢或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基;

或具有式 (I) 的化合物的农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构

体或N-氧化物。

2. 根据权利要求1所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中, $R_4$ 是 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_2-C_6$ 烯基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 羟基烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷硫基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷基亚磺酰基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_3-C_6$ 环烷基- $C_1-C_2$ 烷基、 $C_1-C_6$ 氰基烷基、 $C_3-C_6$ 环烷基或被选自以下组成的组的取代基单取代或多取代的 $C_3-C_6$ 环烷基:卤素、氰基、 $C_1-C_3$ 卤代烷基、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、 $C_1-C_6$ 烷基氨基羰基、 $C_1-C_6$ 二烷基氨基羰基和 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基。

3. 根据权利要求1所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中, $R_4$ 是可以部分饱和或完全饱和的四至六元杂环体系,所述环体系含有1至2个选自O、N、或S(O) $n$ 的环杂原子,其中 $n$ 是0、1或2,其前提是所述杂环体系不含有相邻的氧原子、相邻的硫原子或相邻的硫和氧原子,并且所述氮,当存在时,可以被氢或 $C_1-C_4$ 烷基取代,并且所述环体系可以任选地来自以下组成的组单取代或二取代:卤素、氰基、 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、 $C_1-C_4$ 卤代烷基或氧代基。

4. 根据权利要求1所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中, $R_3$ 和 $R_4$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成5或6元饱和的五或六元环体系,所述环体系可以含有一或两个选自O、N、或S(O) $n$ 的额外的环杂原子,其中 $n$ 是0、1或2,其前提是所述杂环体系不含有相邻的氧原子、相邻的硫原子或相邻的硫和氧原子,并且所述额外的环氮,当存在时,被氢、 $C_1-C_4$ 烷基或 $C_1-C_4$ 烷氧基取代,并且其中所述环体系可以任选地被独立地选自以下的取代基单取代或二取代:卤素、氰基、 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、 $C_1-C_4$ 卤代烷基或氧代基。

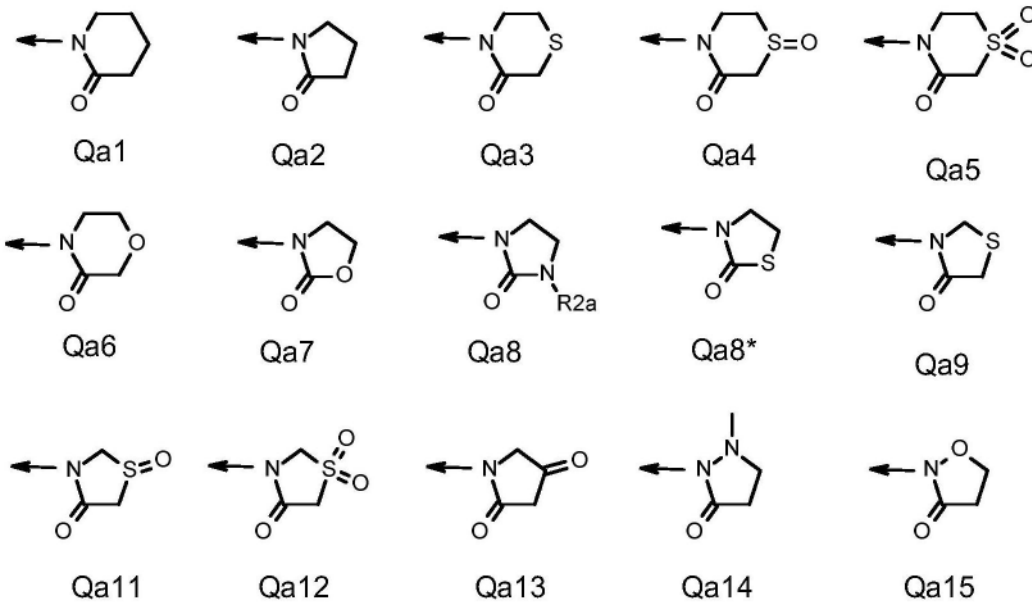
5. 根据权利要求1、2、3或4中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中, $R_1$ 是乙基或环丙基甲基。

6. 根据权利要求1、2、3、4或5中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中, $R_2$ 是 $C_1-C_4$ 卤代烷基、 $C_1-C_4$ 卤代烷基硫烷基、 $C_1-C_4$ 卤代烷基亚磺酰基或 $C_1-C_4$ 卤代烷基磺酰基。

7. 根据权利要求1、2、3、5或6中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中, $R_3$ 是氢、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基或 $C_3-C_6$ 环烷基。

8. 根据权利要求1、2、5、6或7中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中, $R_4$ 是 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 羟基烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷硫基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷基亚磺酰基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基- $C_1-C_4$ 烷基或 $C_3-C_6$ 环烷基。

9. 根据权利要求1、4、5或6中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中, $R_3$ 和 $R_4$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基Qa,所述取代基是选自Qa1至Qa15的基团



其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点,并且其中每个环体系可以被选自由以下组成的组的取代基单取代或二取代:卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、和C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基;其中R<sub>2a</sub>是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基。

10. 根据权利要求1、2、3、4、5、6、7、8或9中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中,X<sub>1</sub>是NR<sub>5</sub>,其中R<sub>5</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基(优选地,NR<sub>5</sub>是N-CH<sub>3</sub>);X是S或SO<sub>2</sub>;R<sub>1</sub>是乙基;并且R<sub>2</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基(优选地,三氟甲基)。

11. 根据权利要求1所述的化合物,其中,

A是CH或N;

X是S或SO<sub>2</sub>;

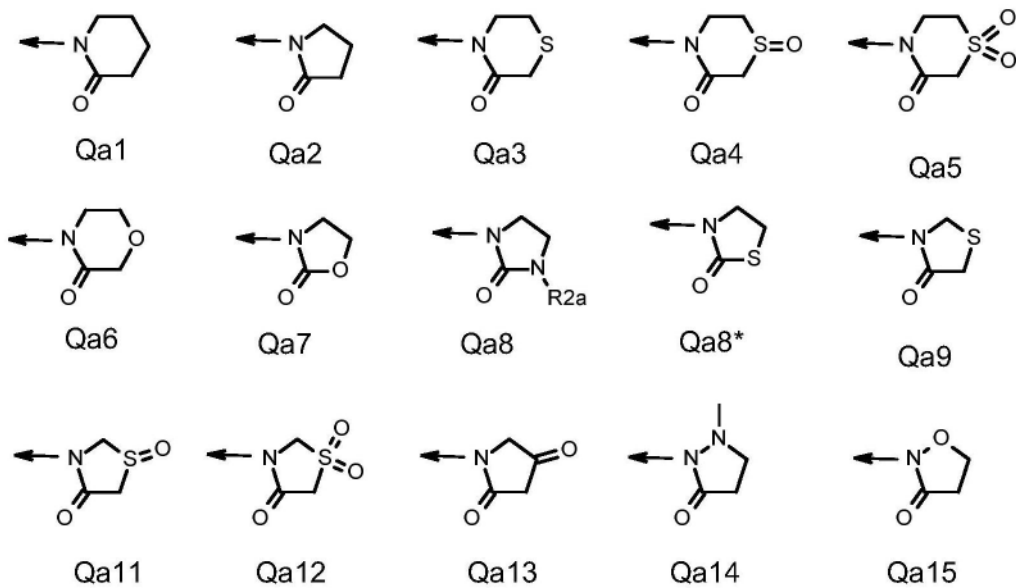
R<sub>1</sub>是乙基或环丙基甲基;

R<sub>2</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基;

R<sub>3</sub>是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基;

R<sub>4</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>羟基烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷硫基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基;或

R<sub>3</sub>和R<sub>4</sub>与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基Qa,所述取代基是选自Qa1至Qa15的基团



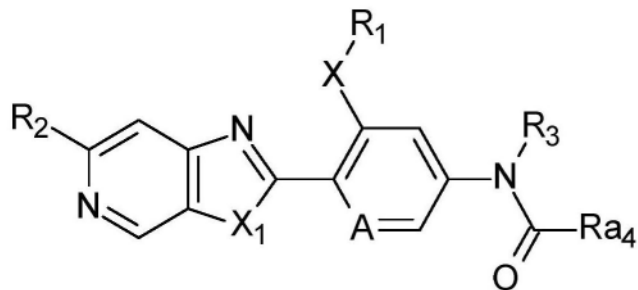
其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点,并且其中每个环体系可以被选自由以下组成的组的取代基单取代或二取代:卤素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、和 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基;其中 $R_{2a}$ 是氢、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、或 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷氧基;并且

$X_1$ 是 $NR_5$ ;其中 $R_5$ 是 $C_1$ - $C_4$ 烷基;

或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物。

12. 根据权利要求1、2、3、4、5、6、7、8、9、10或11中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中,A是N。

13. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物,其由具有式I-1的化合物表示



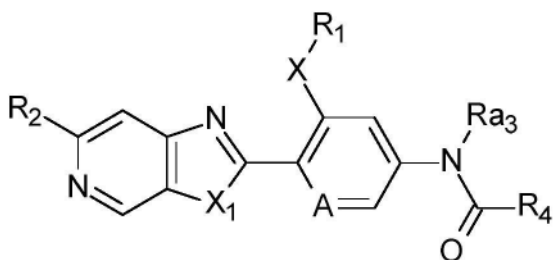
(I-1),

其中A、X、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、和 $X_1$ 是如在权利要求1中在式I下所定义的;并且其中

$Ra_4$ 是 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 羟基烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基或被氰基单取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基;

或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物。

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



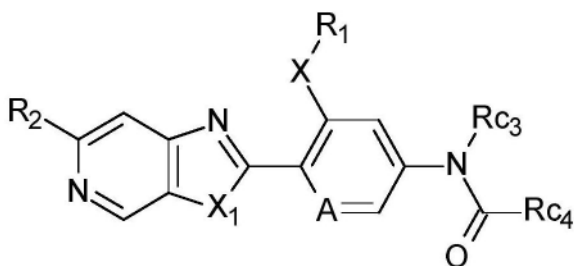
(I-1-1),

其中A、X、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>4</sub>和X<sub>1</sub>是如在权利要求1中在式I下所定义的；并且其中

Ra<sub>3</sub>是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基或被氰基单取代的C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基；

或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物。

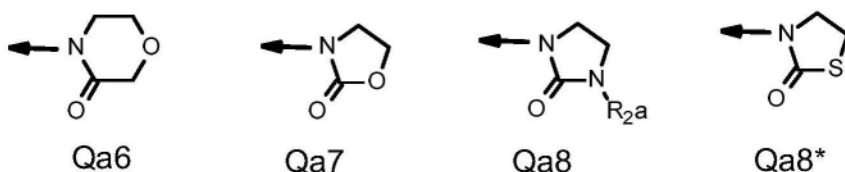
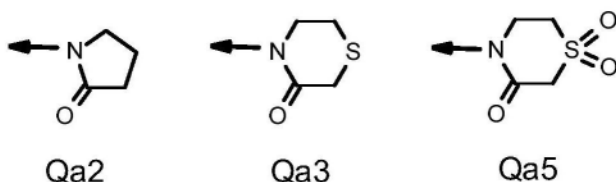
15. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物，其由具有式I-3的化合物表示



(I-3),

其中A、X、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>和X<sub>1</sub>是如在权利要求1中在式I下所定义的；并且其中

Rc<sub>3</sub>和Rc<sub>4</sub>与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基Qa，所述取代基是选自Qa2、Qa3、Qa5、Qa6、Qa7、Qa8和Qa8\*的基团，



其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点；

并且其中R<sub>2a</sub>是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基；优选地，R<sub>2a</sub>是氢、甲基或甲氧基；

或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物。

16. 根据权利要求13、14或15中任一项所述的化合物，或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物，其中，X<sub>1</sub>是NR<sub>5</sub>，其中R<sub>5</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基（优选地，NR<sub>5</sub>是N-CH<sub>3</sub>）；X是S或SO<sub>2</sub>；R<sub>1</sub>是乙基；R<sub>2</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基（优选三氟甲基）并且A是N。

17. 根据权利要求1所述的具有式I的化合物，其选自由以下组成的组：

N-[5-乙基硫烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]环丙烷甲酰胺（化合物P1）；

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]环丙烷甲酰胺(化合物P2);

N-[3-乙基磺酰基-4-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯基]-2,2,2-三氟-乙酰胺(化合物P3);

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]乙酰胺(化合物P4);

1-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]吡咯烷-2-酮(化合物P5);

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙酰胺(化合物P6);

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2-羟基-2-甲基-丙酰胺(化合物P7);

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2-羟基-2-甲基-丙酰胺(化合物P8);

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-环丙烷甲酰胺(化合物P9);

N-环丙基-N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]乙酰胺(化合物P10);

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2,2,2-三氟-N-甲基-乙酰胺(化合物P11);

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2-甲氧基-N-甲基-乙酰胺(化合物P12);

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2,2-二氟-N-甲基-乙酰胺(化合物P13);

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-2-甲基磺酰基-乙酰胺(化合物P14);

4-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]吗啉-3-酮(化合物P15);

N-[3-乙基磺酰基-4-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯基]-N-甲基-乙酰胺(化合物P16);

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-2-甲基磺酰基-乙酰胺(化合物P17);

4-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-1,1-二氧化-1,4-噻嗪烷-3-酮(化合物P18);

4-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]硫代吗啉-3-酮(化合物P19);

2-氯-N-乙基-N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]乙酰胺(化合物P20);

N-乙基-N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡

啶基]乙酰胺(化合物P21)；

2-氯-N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙酰胺(化合物P22)；

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-丙酰胺(化合物P23)；

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲氧基-环丙烷甲酰胺(化合物P24)；

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]丙酰胺(化合物P25)；

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N,2,2-三甲基-丙酰胺(化合物P26)；

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N,2-二甲基-丙酰胺(化合物P27)；

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-3,3,3-三氟-N-甲基-丙酰胺(化合物P28)；

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲氧基-丙酰胺(化合物P29)；

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲氧基-乙酰胺(化合物P30)；

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-3-甲基磺酰基-丙酰胺(化合物P31)；

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-(2,2,2-三氟乙基)丙酰胺(化合物P32)；

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙酰胺(化合物P33)；

3-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]噁唑烷-2-酮(化合物P34)；

1-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-3-甲氧基-咪唑烷-2-酮(化合物P35)；

1-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]咪唑烷-2-酮(化合物P36)；

1-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-3-甲基-咪唑烷-2-酮(化合物P37)；

1-氰基-N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-环丙烷甲酰胺(化合物P38)；

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2,2-二甲基-丙酰胺(化合物P39)；

N-环丙基-N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]丙酰胺(化合物P40)；



N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-3-甲基硫烷基-丙酰胺(化合物P41);

N-(1-氰基环丙基)-N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]乙酰胺(化合物P42);

2-氰基-N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N,2-二甲基-丙酰胺(化合物P43);

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2,2,2-三氟-乙酰胺(化合物P44);

3-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]噻唑烷-2-酮(化合物P45);

N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-异丙基-乙酰胺(化合物P46);以及

N-[5-乙基硫烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-异丙基-乙酰胺(化合物P47)。

18. 一种组合物,其包含杀昆虫、杀螨、杀线虫、或杀软体动物有效量的如权利要求1-17中任一项所定义的具有式(I)的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,以及任选地,助剂或稀释剂。

19. 一种对抗并控制昆虫、螨、线虫或软体动物的方法,所述方法包括向有害生物、有害生物的场所、或易受有害生物攻击的植物施用杀昆虫、杀螨、杀线虫或杀软体动物有效量的如权利要求1-17中任一项所定义的具有式(I)的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,或如权利要求18所定义的组合物。

20. 一种用于保护植物繁殖材料免受昆虫、螨、线虫或软体动物攻击的方法,所述方法包括用根据权利要求18所述的组合物处理所述繁殖材料或所述繁殖材料所种植的场所。

## 具有含硫取代基的杀有害生物活性的杂环衍生物

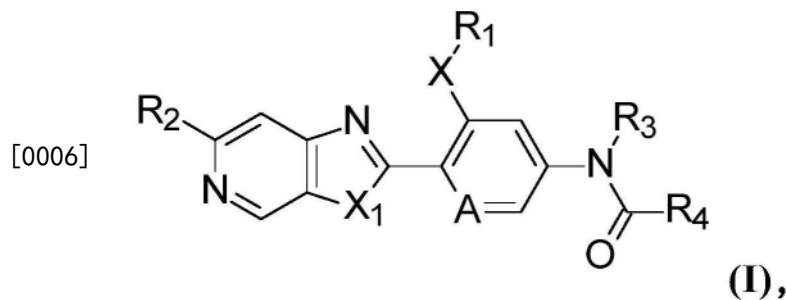
[0001] 本申请是发明名称为“具有含硫取代基的杀有害生物活性的杂环衍生物”的中国发明专利申请No.201980018362.4的分案申请,其申请日是2019年01月10日,最早的优先权日是2018年01月15日。

[0002] 本发明涉及含有硫取代基的杀有害生物活性(特别是杀昆虫活性)的杂环衍生物、涉及其制备方法、涉及包含那些化合物的组合物、并且涉及它们用于控制动物有害生物(包括节肢动物并且特别是昆虫或蜱螨目的代表)的用途。

[0003] 具有杀有害生物作用并且具有硫和环状或非环状酰胺取代基的杂环化合物是已知的并且描述于例如WO 2015121136、WO 2016124557、WO 2016104746、WO 2014142292、WO 2015002211、WO 2014119672、WO 2014119699、WO 2014119494、WO 2014119674、WO 2014119679、WO 2014119670、WO 2016030229、WO 2016124563和WO 2017055185中。

[0004] 现在已经出人意料地发现,某些具有硫和环状或非环状酰胺取代基的新颖的杀有害生物活性的衍生物作为杀有害生物剂具有有利的特性。

[0005] 因此本发明提供了具有式I的化合物,



[0007] 其中

[0008] A是CH或N;

[0009] X是S、SO或SO<sub>2</sub>;

[0010] R<sub>1</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基;

[0011] R<sub>2</sub>是卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基硫烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基磺酰基或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基;

[0012] R<sub>3</sub>是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>氰基烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>羟基烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷硫基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>卤代环烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基或被选自以下的取代基取代的C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基:氰基、卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基、CO<sub>2</sub>H、CONH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>二烷基氨基羰基或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基羰基;

[0013] R<sub>4</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>羟基烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷硫基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>氰基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基或被选自自由以下组成的组的取代基单取代或多取代的C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基:卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基、CO<sub>2</sub>H、CONH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>二烷基氨基羰基和C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基羰基;或

[0014]  $R_4$ 是可以部分饱和或完全饱和的四至六元杂环体系,所述环体系含有1至2个选自O、N、或S(O) $n$ 的环杂原子,其中 $n$ 是0、1或2,其前提是所述杂环体系不含有相邻的氧原子、相邻的硫原子或相邻的硫和氧原子,并且所述环氮,当存在时,可以被氢或 $C_1$ - $C_4$ 烷基取代,并且所述环体系可以任选地来自由以下组成的组单取代或二取代:卤素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基或氧代基(oxo);或

[0015]  $R_3$ 和 $R_4$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成5或6元饱和的五或六元杂环体系,所述杂环体系可以含有一或两个选自O、N、或S(O) $n$ 的额外的环杂原子,其中 $n$ 是0、1或2,其前提是所述杂环体系不含有相邻的氧原子、相邻的硫原子或相邻的硫和氧原子,并且所述额外的环氮,当存在时,被氢或 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、或 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷氧基取代,并且其中所述环体系可以任选地被独立地选自以下的取代基单取代或二取代:卤素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基或氧代基;

[0016]  $X_1$ 是O、S或 $NR_5$ ;其中 $R_5$ 是氢或 $C_1$ - $C_4$ 烷基;或

[0017] 所述具有式I的化合物的农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体和N-氧化物。

[0018] 具有至少一个碱性中心的具有式I的化合物可以例如与以下形成例如酸加成盐:强无机酸(如矿物酸,例如高氯酸、硫酸、硝酸、亚硝酸、磷酸或氢卤酸),强有机羧酸(如未取代的或例如被卤素取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷羧酸,例如乙酸,如饱和或不饱和的二羧酸,例如草酸、丙二酸、琥珀酸、马来酸、富马酸或邻苯二甲酸,如羟基羧酸,例如抗坏血酸、乳酸、苹果酸、酒石酸或柠檬酸,或如苯甲酸),或有机磺酸(如未取代的或例如被卤素取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷磺酸或芳基磺酸,例如甲烷磺酸或对甲苯磺酸)。具有至少一个酸性基团的具有式I的化合物可以例如与碱形成盐,例如矿物盐,例如碱金属或碱土金属盐,例如钠盐、钾盐或镁盐;或与氨或有机胺(例如吗啉,哌啶,吡咯烷,单、二或三低级烷基胺,例如乙胺、二乙胺、三乙胺或二甲基丙基胺,或单、二或三羟基低级烷基胺,例如单乙醇胺、二乙醇胺或三乙醇胺)形成盐。

[0019] 在每种情况下,根据本发明的具有式(I)的化合物是处于游离形式、被氧化的形式如N-氧化物、或盐的形式(例如农艺学上可用的盐的形式)。

[0020] N-氧化物是叔胺的氧化形式或含氮杂芳香族化合物的氧化形式。例如,A.Albini和S.Pietra于1991年在博卡拉顿(Boca Raton)CRC出版社出版的名为“Heterocyclic N-oxides[杂环N-氧化物]”一书中描述了它们。

[0021] 根据本发明的具有式I的化合物还包括在盐形成期间可能形成的水合物。

[0022] 在取代基被指示为本身被进一步取代时,这意指它们带有一个或多个相同的或不同的取代基,例如一至四个取代基。通常地,同时存在不多于三个这样的任选的取代基。优选地,同时存在不多于两个这样的取代基(即,所述基团被一个或两个所指示的取代基取代)。在额外的取代基是较大的基团如环烷基或苯基时,最优选的是仅存在一个这样的任选的取代基。在基团被指示为被取代时,例如烷基,这包括是其他基团的一部分的那些基团,例如烷硫基中的烷基。

[0023] 如本文所用,术语“ $C_1$ - $C_n$ 烷基”是指具有1至 $n$ 个碳原子、经由任一碳原子附接的饱和直链或支链烃基,例如以下基团中的任一种:甲基、乙基、正丙基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、正己基、正戊基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基

丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基、或1-乙基-2-甲基丙基。

[0024] 如本文所用,术语“ $C_2$ - $C_n$ -烯基”是指直链或支链的不饱和烃基,例如乙烯基、烯丙基、均烯丙基、丁-1-烯基、和丁-2-烯基。适当时,烯基链可以具有(E)-或(Z)-构型。

[0025] 如本文所用,术语“ $C_1$ - $C_n$ 卤代烷基”是指具有1至n个碳原子、经由任一碳原子附接的直链或支链饱和烷基(如上所提及的),其中这些基团中的一些或全部氢原子可以被氟、氯、溴和/或碘替代,即,例如以下中的任一种:氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、2-氟乙基、2-氯乙基、2-溴乙基、2-碘乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基、2-氟丙基、3-氟丙基、2,2-二氟丙基、2,3-二氟丙基、2-氯丙基、3-氯丙基、2,3-二氯丙基、2-溴丙基、3-溴丙基、3,3,3-三氟丙基、3,3,3-三氯丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、七氟丙基、1-(氟甲基)-2-氟乙基、1-(氯甲基)-2-氯乙基、1-(溴甲基)-2-溴乙基、4-氟丁基、4-氯丁基、4-溴丁基或九氟丁基。相应地,术语“ $C_1$ - $C_2$ -氟烷基”将是指带有1、2、3、4、或5个氟原子的 $C_1$ - $C_2$ -烷基,例如以下中的任一种:二氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,1,2,2-四氟乙基或五氟乙基。

[0026] 如本文所用,术语“ $C_1$ - $C_n$ 烷氧基”是指具有1至n个碳原子的直链或支链饱和烷基(如上提及的),所述饱和烷基经由氧原子附接,即,例如以下中的任一种:甲氧基、乙氧基、正丙氧基、1-甲基乙氧基、正丁氧基、1-甲基丙氧基、2-甲基丙氧基或1,1-二甲基乙氧基。

[0027] 如本文所用,术语“ $C_1$ - $C_n$ 卤代烷氧基”是指如上所提及的 $C_1$ - $C_n$ 烷氧基,其部分或全部被氟、氯、溴和/或碘取代,即,例如以下中的任一种:氯甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2-溴乙氧基、2-碘乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、五氟乙氧基、2-氟丙氧基、3-氟丙氧基、2,2-二氟丙氧基、2,3-二氟丙氧基、2-氯丙氧基、3-氯丙氧基、2,3-二氯丙氧基、2-溴丙氧基、3-溴丙氧基、3,3,3-三氟丙氧基、3,3,3-三氯丙氧基、2,2,3,3,3-五氟丙氧基、七氟丙氧基、1-(氟甲基)-2-氟乙氧基、1-(氯甲基)-2-氯乙氧基、1-(溴甲基)-2-溴乙氧基、4-氟丁氧基、4-氯丁氧基、或4-溴丁氧基。

[0028] 如本文所用,术语“ $C_1$ - $C_n$ 烷基硫烷基”是指具有1至n个碳原子的直链或支链饱和烷基(如上所提及的),所述饱和烷基经由硫原子附接,即,例如以下中的任一种:甲硫基、乙硫基、正丙硫基、1-甲基乙硫基、丁硫基、1-甲基丙硫基、2-甲基丙硫基或1,1-二甲基乙硫基。

[0029] 如本文所用,术语“ $C_1$ - $C_n$ 烷基亚磺酰基”是指具有1至n个碳原子的直链或支链饱和烷基(如上所提及的),其经由亚磺酰基的硫原子附接,即,例如以下中的任一种:甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正丙基亚磺酰基、1-甲基乙基-亚磺酰基、正丁基亚磺酰基、1-甲基丙基亚磺酰基、2-甲基丙基亚磺酰基、1,1-二甲基-乙基亚磺酰基、正戊基亚磺酰基、1-甲基丁基亚磺酰基、2-甲基丁基亚磺酰基、3-甲基-丁基亚磺酰基、1,1-二甲基丙基亚磺酰基、1,2-二甲基丙基亚磺酰基、2,2-二甲基丙基亚磺酰基或1-乙基丙基亚磺酰基。

[0030] 如本文所用,术语“ $C_1$ - $C_n$ 烷基磺酰基”是指具有1至n个碳原子的直链或支链饱和烷基(如上所提及的),其经由磺酰基的硫原子附接,即,例如以下中的任一种:甲基磺酰基、乙

基磺酰基、正丙基磺酰基、异丙基磺酰基、正丁基磺酰基、1-甲基丙基磺酰基、2-甲基丙基磺酰基或叔丁基磺酰基。

[0031] 如本文所用,术语“ $C_1-C_n$ 卤代烷基硫烷基”是指如上所提及的 $C_1-C_n$ 烷硫基,其部分或全部被氟、氯、溴和/或碘取代,即,例如以下中的任一种:氟甲硫基、二氟甲硫基、三氟甲硫基、氯二氟甲硫基、溴二氟甲硫基、2-氟乙硫基、2-氯乙硫基、2-溴乙硫基、2-碘乙硫基、2,2-二氟乙硫基、2,2,2-三氟乙硫基、2,2,2-三氯乙硫基、2-氯-2-氟乙硫基、2-氯-2,2-二氟乙硫基、2,2-二氯-2-氟乙硫基、五氟乙硫基、2-氟丙硫基、3-氟丙硫基、2-氯丙硫基、3-氯丙硫基、2-溴丙硫基、3-溴丙硫基、2,2-二氟丙硫基、2,3-二氟丙硫基、2,3-二氯丙硫基、3,3,3-三氟丙硫基、3,3,3-三氯丙硫基、2,2,3,3,3-五氟丙硫基、七氟丙硫基、1-(氟甲基)-2-氟乙硫基、1-(氯甲基)-2-氯乙硫基、1-(溴甲基)-2-溴乙硫基、4-氟丁硫基、4-氯丁硫基、或4-溴丁硫基。

[0032] 术语“ $C_1-C_n$ 卤代烷基亚磺酰基”和“ $C_1-C_n$ 卤代烷基磺酰基”是指以上基团,但是其中硫分别处于氧化态1或2。

[0033] 如本文所用,术语“ $C_1-C_n$ 烷氧基羰基”是指具有1至n个碳原子的直链或支链烷氧基(如上所提及),其经由羰基的碳原子附接,即,例如以下中的任一种:甲氧基羰基、乙氧基羰基、正丙氧基羰基、1-甲基乙氧基羰基、正丁氧基羰基、1-甲基丙氧基羰基、2-甲基丙氧基羰基或1,1-二甲基乙氧基羰基。

[0034] 如本文所用,术语“ $C_1-C_n$ -烷基氨基羰基”是指具有1至n个碳原子的直链或支链饱和烷基(如上所提及的)氨基链,其经由羰基附接,例如,N-甲基甲酰胺、N-乙基甲酰胺、N-丙基甲酰胺、N-丁基甲酰胺和N-仲丁基甲酰胺。

[0035] 如本文所用,术语“ $C_1-C_n$ -二烷基氨基羰基”是指两个具有1至n个碳原子的直链或支链饱和烷基(如上所提及的)氨基链,其经由羰基附接,例如N,N-二甲基甲酰胺、N-乙基-N-甲基-甲酰胺、N-异丙基-N-甲基-甲酰胺、N-乙基-N-丙基-甲酰胺、N-乙基-N-异丙基-甲酰胺、和N-异丁基-N-甲基-甲酰胺

[0036] 如本文所用,术语“ $C_1-C_n$ 氰基烷基”是指具有1至n个碳原子的直链或支链饱和烷基(如上所提及的),其被氰基取代,例如氰基亚甲基、氰基亚乙基、1,1-二甲基氰基甲基、氰基甲基、氰基乙基和1-二甲基氰基甲基。

[0037] 如本文所用,在术语(如“ $C_1-C_n$ 烷氧基”)前的前缀“ $-C_1-C_n$ 烷基”(其中n是从1-6的整数)是指被 $C_1-C_n$ 烷氧基取代的直链或支链饱和烷基。 $C_1-C_n$ 烷氧基- $C_1-C_n$ 烷基的实例是例如,甲氧基甲基、甲氧基乙基以及1-甲基甲氧基甲基。

[0038] 如本文所用,术语“ $C_3-C_6$ 环烷基”是指3-6元环烷基,如环丙烷、环丁烷、环丙烷、环戊烷和环己烷。

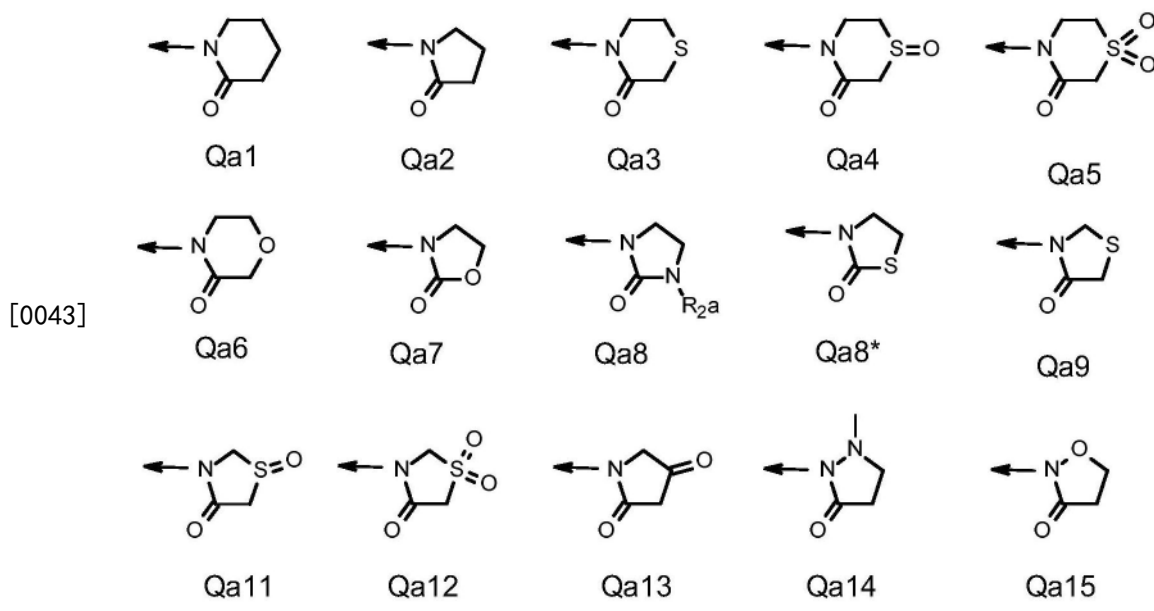
[0039] 卤素通常是氟、氯、溴或碘。这也相应地适用于与其他含义组合的卤素,如卤代烷基

[0040] 如本文所用,术语“可以部分饱和或完全饱和的四至六元杂环体系,所述环体系含有1至2个选自O、N、或S(O)<sub>n</sub>的环杂原子,其中n是0、1或2,其前提是所述杂环体系不含有相邻的氧原子、相邻的硫原子或相邻的硫和氧原子,并且所述环氮,当存在时,可以被氢或 $C_1-C_4$ 烷基取代,并且所述环体系可以任选地来自由以下组成的组单取代或二取代:卤素、氰基、 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、 $C_1-C_4$ 卤代烷基或氧代基”是例如由以下例示:氮杂环丁基

(azetidyl)、吡咯烷基、吡唑啉基、咪唑啉基、吡咯啉基、吡唑啉基、咪唑啉基、四氢呋喃基、二氢呋喃基、1,3-二氧戊环基、二氧杂环戊烯基(dioxolanyl)、四氢噻吩基(thiolanyl)、二氢噻吩基、噁唑烷基、异噁唑烷基、噁唑啉基、异噁唑啉基、噻唑啉基、异噻唑啉基、噻唑烷基、异噻唑烷基、氧硫杂环戊烷基(oxathiolanyl)、哌啶基、哌嗪基、吡喃基、二氢吡喃基、四氢吡喃基、二噁烷基、硫代吡喃基、二氢硫代吡喃基、四氢硫代吡喃基、吗啉基、噻嗪基等。

[0041] 如本文所用,术语“ $R_3$ 和 $R_4$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成5或6元饱和的五或六元杂环体系,所述杂环体系可以含有一或两个选自O、N、或S(O) $_n$ 的额外的环杂原子,其中 $n$ 是0、1或2,其前提是所述杂环体系不含有相邻的氧原子、相邻的硫原子或相邻的硫和氧原子,并且所述额外的环氮,当存在时,被氢或 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、或 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷氧基取代,并且其中所述环体系可以任选地被独立地选自以下的取代基单取代或二取代:卤素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基或氧代基”最好用被取代基 $Q_a$ 取代的苯基或吡啶基来描述,其中 $Q_a$ 是例如:

[0042]  $Q_a$ 是 $Q_{a1}$ 至 $Q_{a15}$ 的基团



[0044] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点,并且其中每个环体系可以被选自由以下组成的组的取代基单取代或多取代:卤素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、和 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基;其中 $R_{2a}$ 是氢、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、和 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷氧基。

[0045] A、X、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、和 $X_1$ 的优选值是以其任何组合如以下列出的:

[0046] 优选地,A是N。

[0047] 优选地,X是S或 $SO_2$ 。

[0048] 最优选地,X是 $SO_2$ 。

[0049] 优选地, $R_1$ 是乙基或环丙基甲基。

[0050] 最优选地, $R_1$ 是乙基。

[0051] 优选地, $R_2$ 是 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基硫烷基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基亚磺酰基或 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基磺酰基。

[0052] 更优选地, $R_2$ 是 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基。

[0053] 最优选地, $R_2$ 是三氟甲基。

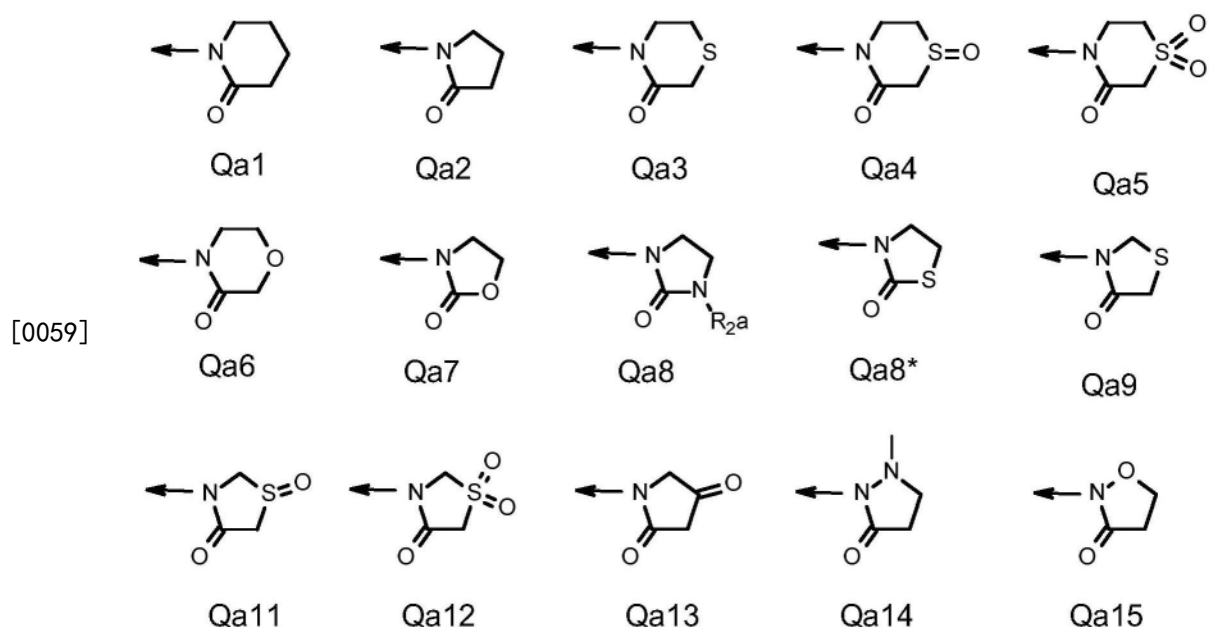
[0054] 优选地,  $R_3$  是氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基或被氰基单取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基。

[0055] 最优选地,  $R_3$  是氢、甲基、乙基、异丙基、2,2,2-三氟乙基、甲氧基、环丙基或1-氰基环丙基。

[0056] 优选地,  $R_4$  是 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 羟基烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基或被氰基单取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基。

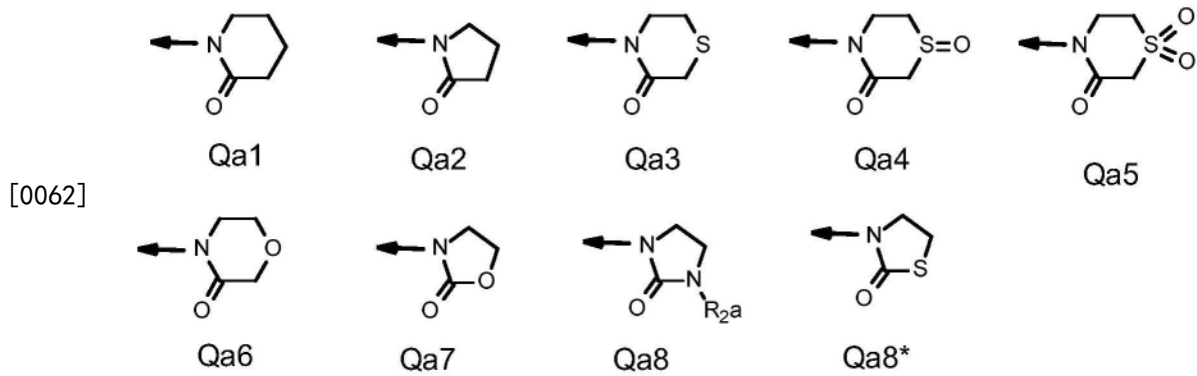
[0057] 最优选地,  $R_4$  是甲基、乙基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、二氟甲基、氯甲基、2,2,2-三氟乙基、1-羟基-1-甲基-乙基、甲氧基甲基、甲基硫烷基甲基、甲基磺酰基甲基、2-甲基硫烷基乙基、2-甲基磺酰基乙基、1-氰基-1-甲基-乙基、环丙基或1-氰基环丙基; 或

[0058]  $R_3$ 和 $R_4$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基Qa, 所述取代基是选自Qa1至Qa15的基团



[0060] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点, 并且其中每个环体系可以被选自由以下组成的组的取代基单取代或多取代: 卤素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、和 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基; 其中 $R_{2a}$ 是氢、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、或 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷氧基。

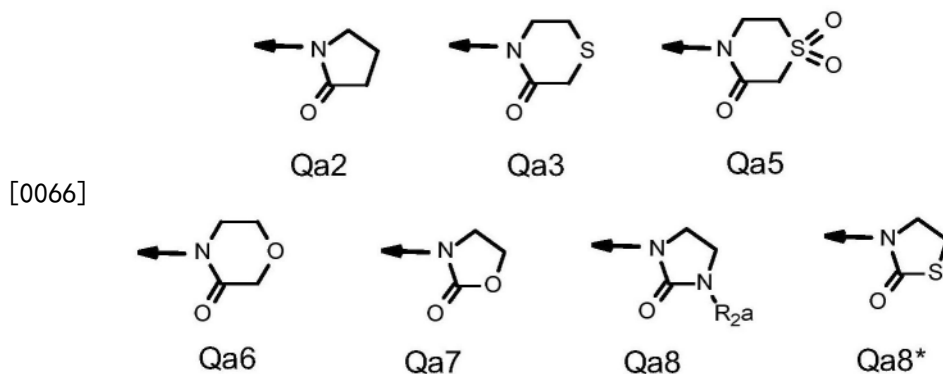
[0061] 如果 $R_3$ 和 $R_4$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基Qa, 则最优选地, 取代基Qa是选自Qa1、Qa2、Qa3、Qa4、Qa5、Qa6、Qa7、Qa8和Qa8\*的基团; 特别地, 取代基Qa是选自Qa1、Qa2、Qa3、Qa4、Qa5和Qa6的基团,



[0063] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点；

[0064] 并且其中R<sub>2a</sub>是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基；优选地，R<sub>2a</sub>是氢、甲基或甲氧基。

[0065] 最优选地，取代基Qa是选自Qa2、Qa3、Qa5、Qa6、Qa7、Qa8和Qa8\*的基团，



[0067] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点；

[0068] 并且其中R<sub>2a</sub>是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基；优选地，R<sub>2a</sub>是氢、甲基或甲氧基。

[0069] 优选地，X<sub>1</sub>是NR<sub>5</sub>；其中R<sub>5</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基。

[0070] 最优选地，X<sub>1</sub>是N-CH<sub>3</sub>。

[0071] 提供了根据本发明的实施例，如下面列出的。

[0072] 实施例1提供了如上所定义的具有式I的化合物或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物。

[0073] 实施例2提供了根据实施例1所述的化合物，或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物，其中，R<sub>4</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>羟基烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷硫基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>氰基烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基或被选自由以下组成的组的取代基单取代或多取代的C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基：卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基、CO<sub>2</sub>H、CONH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氨基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>二烷基氨基羰基和C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基羰基。

[0074] 实施例3提供了根据实施例1所述的化合物，或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物，其中，R<sub>4</sub>是可以部分饱和或完全饱和的四至六元杂环体系，所述环体系含有1至2个选自O、N、或S(O)<sub>n</sub>的杂原子，其中n是0、1或2并且所述氮可以被氢或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基取代，并且所述环体系可以任选地来自自由以下组成的组单取代或二取代：卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基或氧代基。

[0075] 实施例4提供了根据实施例1中任一项所述的化合物，或其农用化学上可接受的



盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中, $R_3$ 和 $R_4$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成5或6元饱和的五或六元环体系,所述环体系可以含有一或两个选自O、N、或S(O) $_n$ 的杂原子,其中n是0、1或2,并且所述环氮(当存在时)被氢或 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、或 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷氧基取代,并且其中所述环体系可以任选地被独立地选自以下的取代基单取代或二取代:卤素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基或氧代基。

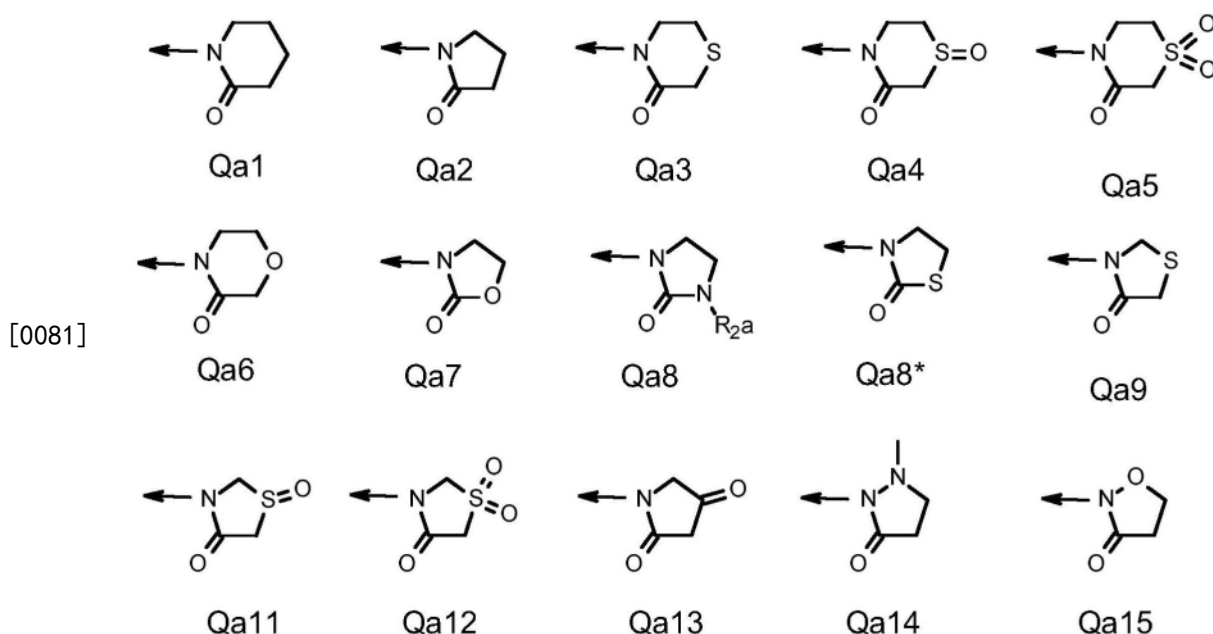
[0076] 实施例5提供了根据实施例1、2、3或4中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中, $R_1$ 是乙基或环丙基甲基。

[0077] 实施例6提供了根据实施例1、2、3、4或5中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中, $R_2$ 是 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基硫烷基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基亚磺酰基或 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基磺酰基。

[0078] 实施例7提供了根据实施例1、2、3、5或6中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中, $R_3$ 是氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基或被氰基单取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基。

[0079] 实施例8提供了根据实施例1、2、5、6或7中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中, $R_4$ 是 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 羟基烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基或被氰基单取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基。

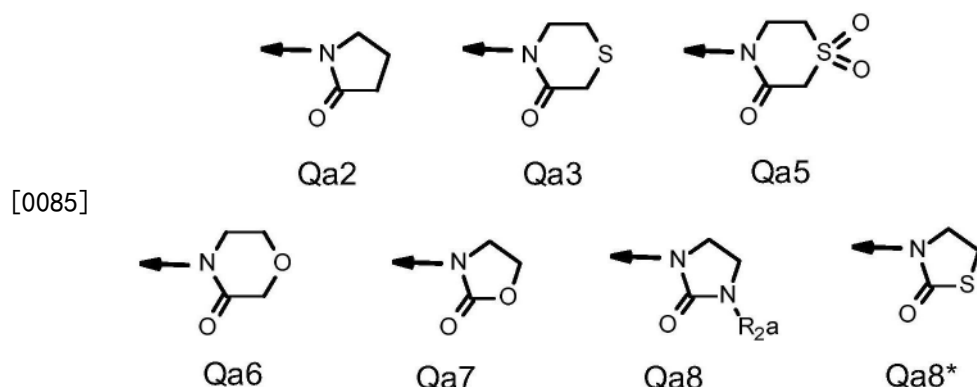
[0080] 实施例9提供了根据实施例1、4、5或6中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中 $R_3$ 和 $R_4$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基Qa,所述取代基是选自Qa1至Qa15的基团



[0082] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点,并且其中每个环体系可以被选自由以下组成的组的取代基单取代或多取代:卤素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、和 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基;其中 $R_{2a}$ 是氢、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、或 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷氧基。

[0083] 实施例10提供了根据实施例1、4、5、6或9中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中 $R_3$ 和 $R_4$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基Qa,所述取代基是选自

[0084] Qa2、Qa3、Qa5、Qa6、Qa7、Qa8和Qa8\*的基团,



[0086] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点;

[0087] 并且其中 $R_{2a}$ 是氢、 $C_1$ - $C_4$ 烷基或 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基;优选地, $R_{2a}$ 是氢、甲基或甲氧基。

[0088] 实施例11提供了根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9或10中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中 $X_1$ 是 $NR_5$ ,其中 $R_5$ 是 $C_1$ - $C_4$ 烷基。

[0089] 实施例12提供了根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10或11中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中X是S或 $SO_2$ 。

[0090] 实施例13提供了根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11或12中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中, $R_1$ 是乙基。

[0091] 实施例14提供了根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12或13中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中, $R_2$ 是 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基。

[0092] 实施例15提供了根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13或14中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中, $X_1$ 是N- $CH_3$ 。

[0093] 实施例16提供了根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14或15中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中, $R_2$ 是三氟甲基。

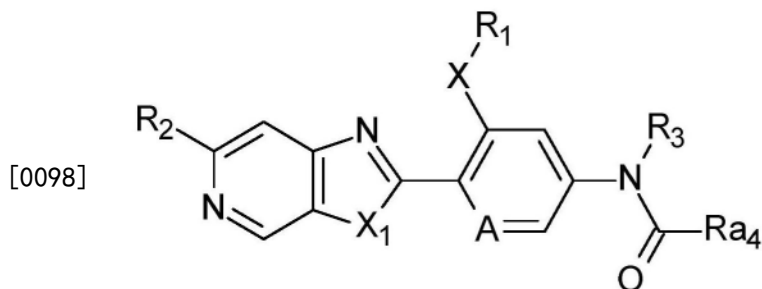
[0094] 实施例17提供了根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15或16中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中,X是 $SO_2$ 。

[0095] 实施例18提供了根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16或17中任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中,A是N。

[0096] 实施例19提供了根据实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16或17中

任一项所述的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中,A是CH。

[0097] 根据本发明的一组具有式I的化合物是具有式I-1的那些



(I-1),

[0099] 其中,A、X、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、和 $X_1$ 是如对于具有式I(上文)的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物所定义的,并且其中, $Ra_4$ 是 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 羟基烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基- $C_1$ - $C_2$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基或被选自由以下组成的组的取代基单取代或多取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基:卤素、氰基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、 $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基羰基、 $C_1$ - $C_6$ 二烷基氨基羰基和 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基。

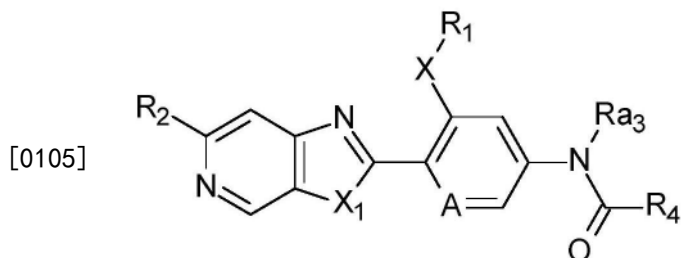
[0100] A、X、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、和 $X_1$ 的优选定义是如对于具有式I(上文)的化合物所定义的,并且优选地, $Ra_4$ 是 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 羟基烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基或被氰基单取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基。

[0101] 在式I-1的一个实施例中,优选地, $R_3$ 是氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基或被氰基单取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基。

[0102] 根据此实施例的一组化合物是具有式(I-1a)的化合物,其是具有式(I-1)的化合物,其中A是N。

[0103] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-1b)的化合物,其是具有式(I-1)的化合物,其中A是CH。

[0104] 根据本发明的另一组具有式I的化合物是具有式I-1-1的那些



(I-1-1),

[0106] 其中,A、X、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_4$ 、和 $X_1$ 是如对于具有式I(上文)的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物所定义的,并且其中,

[0107]  $Ra_3$ 是氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基、 $C_1$ - $C_6$ 羟基烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基- $C_1$ - $C_4$

烷基、 $C_1-C_4$ 烷基亚磺酰基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_3-C_6$ 环烷基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_3-C_6$ 卤代环烷基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_3-C_6$ 环烷基或被选自以下的取代基取代的 $C_3-C_6$ 环烷基：氰基、卤素、 $C_1-C_3$ 卤代烷基、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、 $C_1-C_6$ 烷基氨基羰基、 $C_1-C_6$ 二烷基氨基羰基或 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基。

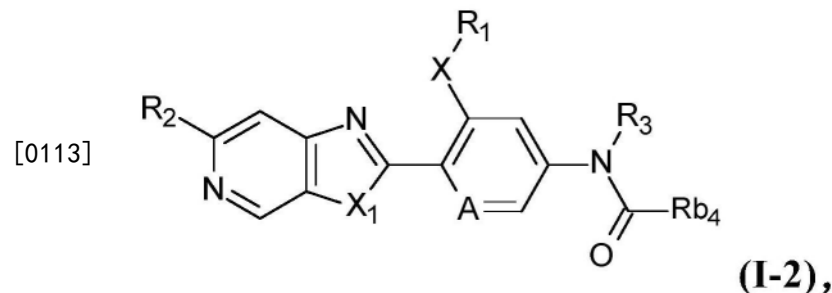
[0108] A、X、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_4$ 和 $X_1$ 的优选定义是如对于具有式I(上文)的化合物所定义的,并且优选地, $Ra_3$ 是氢、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_3-C_6$ 环烷基或被氰基单取代的 $C_3-C_6$ 环烷基。

[0109] 在式I-1-1的一个实施例中, $R_4$ 是 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 羟基烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷硫基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷基亚磺酰基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_6$ 氰基烷基、 $C_3-C_6$ 环烷基或被氰基单取代的 $C_3-C_6$ 环烷基。

[0110] 根据此实施例的一组化合物是具有式(I-1-1a)的化合物,其是具有式(I-1-1)的化合物,其中A是N。

[0111] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-1-1b)的化合物,其是具有式(I-1-1)的化合物,其中A是CH。

[0112] 根据本发明的另一组具有式I的化合物是具有式I-2的那些



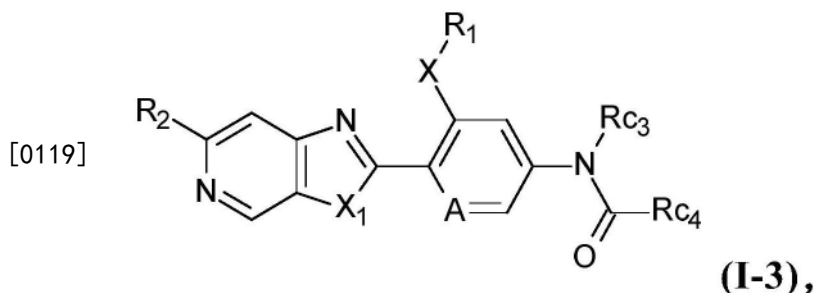
[0114] 其中,A、X、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 和 $X_1$ 是如对于具有式I(上文)的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物所定义的,并且其中, $Rb_4$ 是可以部分饱和或完全饱和的四至六元杂环体系,所述环体系含有1至2个选自O、N、或S(O) $n$ 的环杂原子,其中n是0、1或2,其前提是所述杂环体系不含有相邻的氧原子、相邻的硫原子或相邻的硫和氧原子,并且所述环氮,当存在时,可以被氢或 $C_1-C_4$ 烷基取代,并且所述环体系可以任选地来自由以下组成的组单取代或二取代:卤素、氰基、 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、 $C_1-C_4$ 卤代烷基或氧代基。

[0115] A、X、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 和 $X_1$ 的优选定义是如对于具有式I(上文)的化合物所定义的。

[0116] 根据此实施例的一组化合物是具有式(I-2a)的化合物,其是具有式(I-2)的化合物,其中A是N。

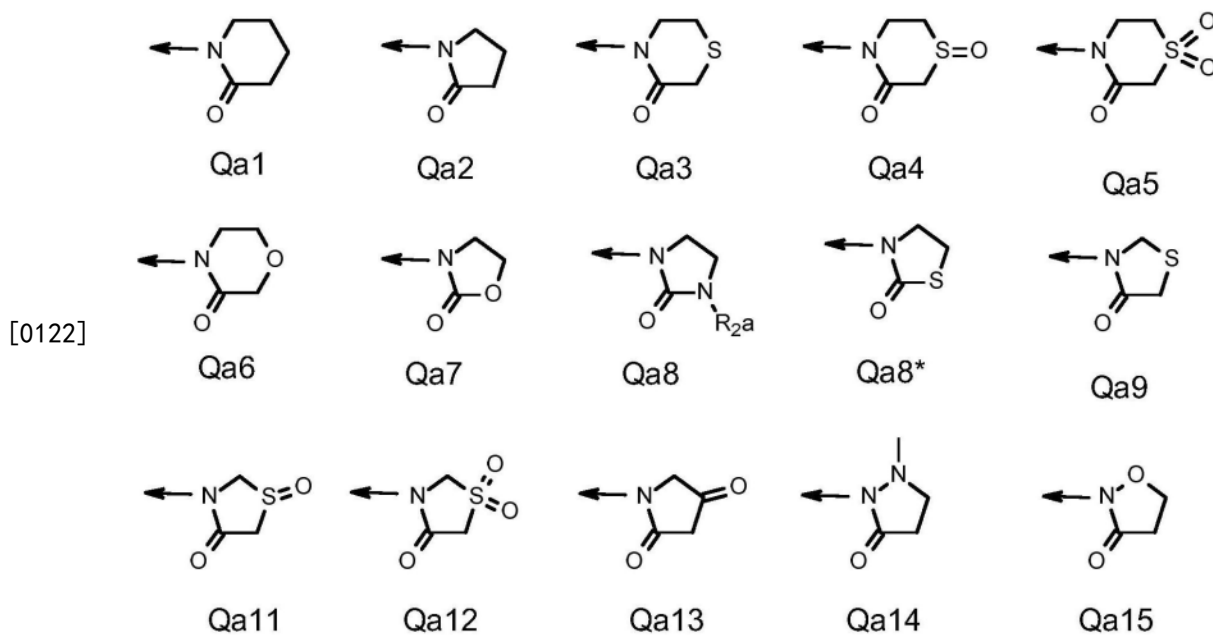
[0117] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-2b)的化合物,其是具有式(I-2)的化合物,其中A是CH。

[0118] 根据本发明的另一组具有式I的化合物是具有式I-3的那些

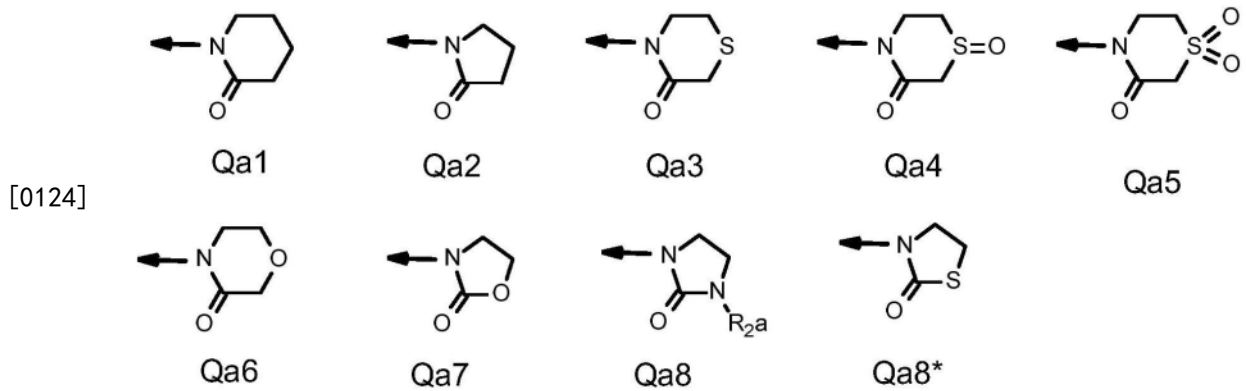


[0120] 其中, A、X、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、和X<sub>1</sub>是如对于具有式I(上文)的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物所定义的,并且其中,Rc<sub>3</sub>和Rc<sub>4</sub>与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成5或6元饱和的五或六元杂环体系,所述杂环体系可以含有一或两个选自O、N、或S(O)<sub>n</sub>的额外的环杂原子,其中n是0、1或2,其前提是所述杂环体系不含有相邻的氧原子、相邻的硫原子或相邻的硫和氧原子,并且所述环氮(当存在时)被氢或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基取代,并且其中所述环体系可以任选地被独立地选自以下的取代基单取代或二取代:卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基或氧代基。

[0121] A、X、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>和X<sub>1</sub>的优选定义是如对于具有式I(以上)的化合物所定义的,并且优选地,Rc<sub>3</sub>和Rc<sub>4</sub>与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基Qa,所述取代基是选自Qa1至Qa15的基团



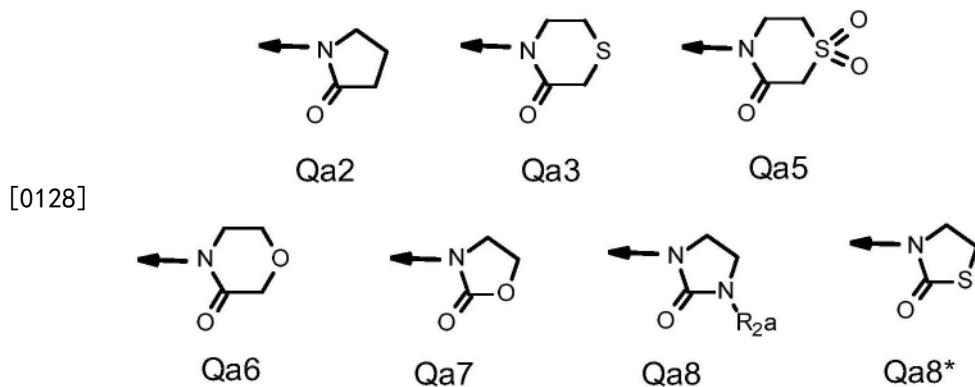
[0123] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点,并且其中每个环体系可以被选自由以下组成的组的取代基单取代或多取代:卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、和C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基;其中R<sub>2a</sub>是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基。最优选地,Rc<sub>3</sub>和Rc<sub>4</sub>与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基Qa,所述取代基是选自Qa1、Qa2、Qa3、Qa4、Qa5、Qa6、Qa7、Qa8和Qa8\*的基团;特别地,取代基Qa是选自Qa1、Qa2、Qa3、Qa4、Qa5和Qa6的基团,



[0125] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点；

[0126] 并且其中 $R_{2a}$ 是氢、 $C_1-C_4$ 烷基或 $C_1-C_4$ 烷氧基；优选地， $R_{2a}$ 是氢、甲基或甲氧基。

[0127] 甚至更优选地，取代基Qa是选自Qa2、Qa3、Qa5、Qa6、Qa7、Qa8和Qa8\*的基团，



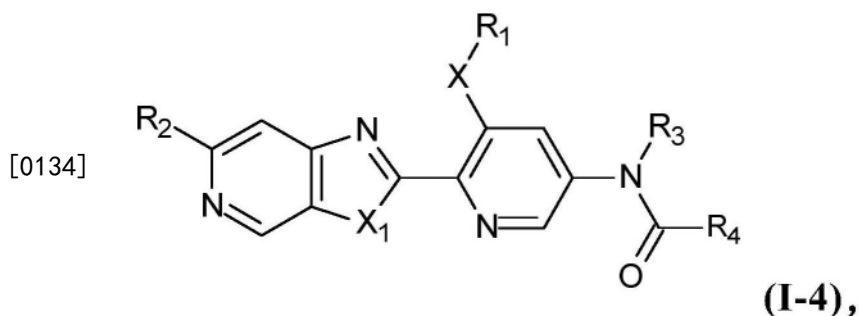
[0129] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点；

[0130] 并且其中 $R_{2a}$ 是氢、 $C_1-C_4$ 烷基或 $C_1-C_4$ 烷氧基；优选地， $R_{2a}$ 是氢、甲基或甲氧基。

[0131] 根据此实施例的一组化合物是具有式(I-3a)的化合物，其是具有式(I-3)的化合物，其中A是N。

[0132] 根据此实施例的另一组化合物是具有式(I-3b)的化合物，其是具有式(I-3)的化合物，其中A是CH。

[0133] 根据本发明的另一组具有式I的化合物是具有式I-4的那些



[0135] 其中，X、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 和 $X_1$ 是如对于具有式I(上文)的化合物，或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物所定义的。

[0136] X、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 和 $X_1$ 的优选定义是如对于具有式I(上文)的化合物所定义的。

[0137] 根据此实施例的一组化合物是具有式(I-4a)的化合物，其是具有式(I-4)的化合物，其中 $R_4$ 是 $C_1-C_6$ 烷基。

[0138] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-4b) 的化合物,其是具有式 (I-4) 的化合物,其中 $R_4$ 是 $C_2$ - $C_6$ 烯基。

[0139] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-4c) 的化合物,其是具有式 (I-4) 的化合物,其中 $R_4$ 是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基。

[0140] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-4d) 的化合物,其是具有式 (I-4) 的化合物,其中 $R_4$ 是 $C_1$ - $C_6$ 羟基烷基。

[0141] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-4e) 的化合物,其是具有式 (I-4) 的化合物,其中 $R_4$ 是 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基。

[0142] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-4f) 的化合物,其是具有式 (I-4) 的化合物,其中 $R_4$ 是 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基- $C_1$ - $C_4$ 烷基。

[0143] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-4g) 的化合物,其是具有式 (I-4) 的化合物,其中 $R_4$ 是 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基。

[0144] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-4h) 的化合物,其是具有式 (I-4) 的化合物,其中 $R_4$ 是 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基。

[0145] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-4i) 的化合物,其是具有式 (I-4) 的化合物,其中 $R_4$ 是 $C_3$ - $C_6$ 环烷基- $C_1$ - $C_2$ 烷基。

[0146] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-4j) 的化合物,其是具有式 (I-4) 的化合物,其中 $R_4$ 是 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基。

[0147] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-4k) 的化合物,其是具有式 (I-4) 的化合物,其中 $R_4$ 是 $C_3$ - $C_6$ 环烷基。

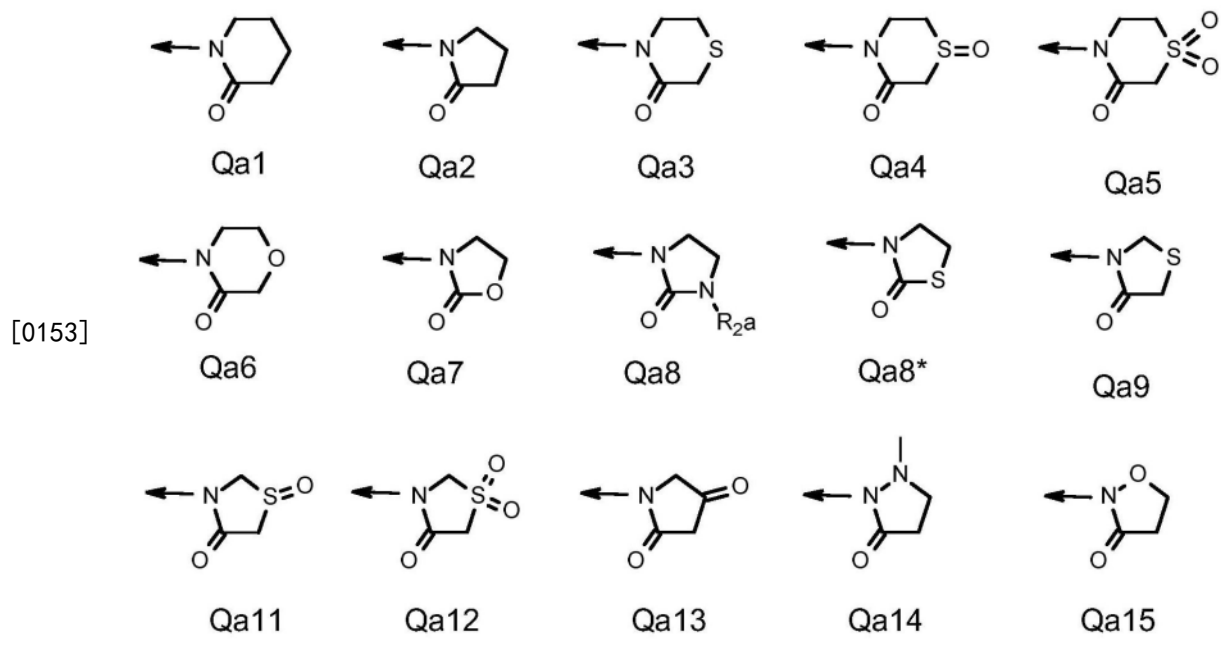
[0148] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-4l) 的化合物,其是具有式 (I-4) 的化合物,其中 $R_4$ 是被选自由以下组成的组的取代基单取代或多取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基:卤素、氰基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、 $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基羰基、 $C_1$ - $C_6$ 二烷基氨基羰基和 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基。

[0149] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-4m) 的化合物,其是具有式 (I-4) 的化合物,其中 $R_4$ 是可以部分饱和或完全饱和的四至六元杂环体系,所述环体系含有1至2个选自O、N、或S(O) $n$ 的环杂原子,其中 $n$ 是0、1或2,其前提是所述杂环体系不含有相邻的氧原子、相邻的硫原子或相邻的硫和氧原子,并且所述环氮(当存在时)可以被氢或 $C_1$ - $C_4$ 烷基取代,并且所述环体系可以任选地来自自由以下组成的组单取代或二取代:卤素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基或氧代基。

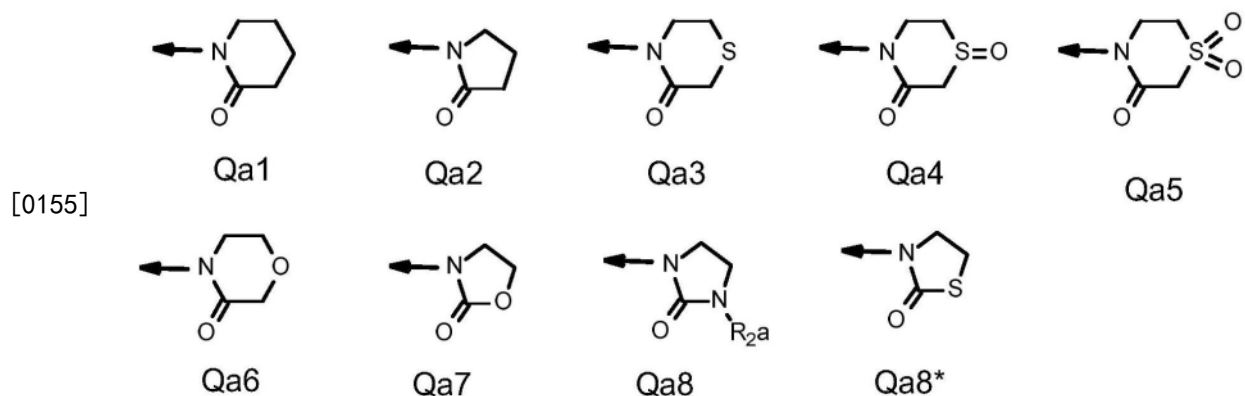
[0150] 在具有式 (I-4a) 至 (I-4m) 的化合物中, $X$ 、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 和 $X_1$ 的优选定义是如对于具有式I(上文)的化合物所定义的。

[0151] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-4n) 的化合物,其是具有式 (I-4) 的化合物,其中 $R_3$ 和 $R_4$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成5或6元饱和的杂环体系,所述杂环体系可以含有一或两个选自O、N、或S(O) $n$ 的额外的环杂原子,其中 $n$ 是0、1或2,其前提是所述杂环体系不含有相邻的氧原子、相邻的硫原子或相邻的硫和氧原子,并且所述环氮(当存在时)被氢或 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、或 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷氧基取代,并且其中所述环体系可以任选地被独立地选自以下的取代基单取代或二取代:卤素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基或氧代基;以及

[0152] 在具有式(I-4n)的化合物中,  $X$ 、 $R_1$ 、 $R_2$ 和 $X_1$ 的优选定义是如对于具有式I(以上)的化合物所定义的, 并且优选地,  $R_3$ 和 $R_4$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基 $Q_a$ , 所述取代基是选自 $Q_{a1}$ 至 $Q_{a15}$ 的基团



[0154] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点, 并且其中每个环体系可以被选自由以下组成的组的取代基单取代或多取代: 卤素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、和 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基; 其中 $R_{2a}$ 是氢、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、或 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷氧基。最优选地,  $R_3$ 和 $R_4$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基 $Q_a$ , 所述取代基是选自 $Q_{a1}$ 、 $Q_{a2}$ 、 $Q_{a3}$ 、 $Q_{a4}$ 、 $Q_{a5}$ 、 $Q_{a6}$ 、 $Q_{a7}$ 、 $Q_{a8}$ 和 $Q_{a8^*}$ 的基团; 特别地, 取代基 $Q_a$ 是选自 $Q_{a1}$ 、 $Q_{a2}$ 、 $Q_{a3}$ 、 $Q_{a4}$ 、 $Q_{a5}$ 和 $Q_{a6}$ 的基团,

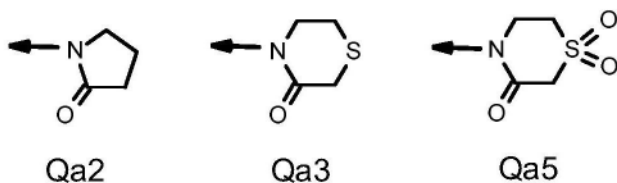


[0156] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点;

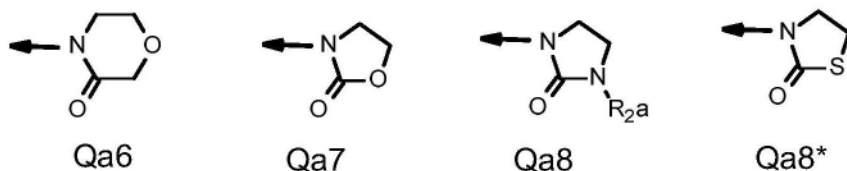
[0157] 并且其中 $R_{2a}$ 是氢、 $C_1$ - $C_4$ 烷基或 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基; 优选地,  $R_{2a}$ 是氢、甲基或甲氧基。

[0158] 甚至更优选地, 取代基 $Q_a$ 是选自 $Q_{a2}$ 、 $Q_{a3}$ 、 $Q_{a5}$ 、 $Q_{a6}$ 、 $Q_{a7}$ 、 $Q_{a8}$ 和 $Q_{a8^*}$ 的基团,





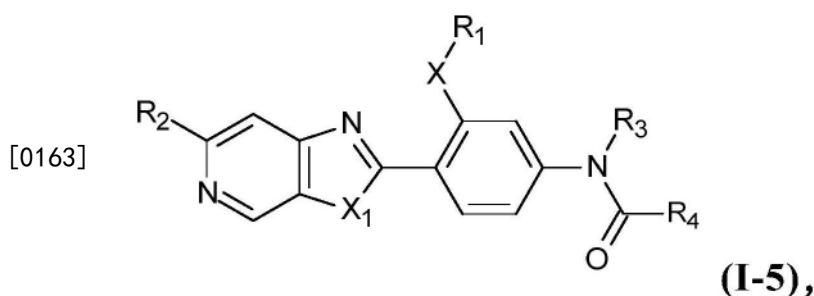
[0159]



[0160] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点；

[0161] 并且其中R<sub>2a</sub>是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基；优选地，R<sub>2a</sub>是氢、甲基或甲氧基。

[0162] 根据本发明的另一组具有式I的化合物是具有式I-5的那些

[0164] 其中，X、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>和X<sub>1</sub>是如对于具有式I（上文）的化合物，或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物所定义的。[0165] X、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>和X<sub>1</sub>的优选定义是如对于具有式I（上文）的化合物所定义的。[0166] 根据此实施例的一组化合物是具有式（I-5a）的化合物，其是具有式（I-5）的化合物，其中R<sub>4</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基。[0167] 根据此实施例的另一组化合物是具有式（I-5b）的化合物，其是具有式（I-5）的化合物，其中R<sub>4</sub>是C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基。[0168] 根据此实施例的另一组化合物是具有式（I-5c）的化合物，其是具有式（I-5）的化合物，其中R<sub>4</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基。[0169] 根据此实施例的另一组化合物是具有式（I-5d）的化合物，其是具有式（I-5）的化合物，其中R<sub>4</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>羟基烷基。[0170] 根据此实施例的另一组化合物是具有式（I-5e）的化合物，其是具有式（I-5）的化合物，其中R<sub>4</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基。[0171] 根据此实施例的另一组化合物是具有式（I-5f）的化合物，其是具有式（I-5）的化合物，其中R<sub>4</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷硫基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基。[0172] 根据此实施例的另一组化合物是具有式（I-5g）的化合物，其是具有式（I-5）的化合物，其中R<sub>4</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基。[0173] 根据此实施例的另一组化合物是具有式（I-5h）的化合物，其是具有式（I-5）的化合物，其中R<sub>4</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基。[0174] 根据此实施例的另一组化合物是具有式（I-5i）的化合物，其是具有式（I-5）的化合物，其中R<sub>4</sub>是C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基。

[0175] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-5j) 的化合物,其是具有式 (I-5) 的化合物,其中 $R_4$ 是 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基。

[0176] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-5k) 的化合物,其是具有式 (I-5) 的化合物,其中 $R_4$ 是 $C_3$ - $C_6$ 环烷基。

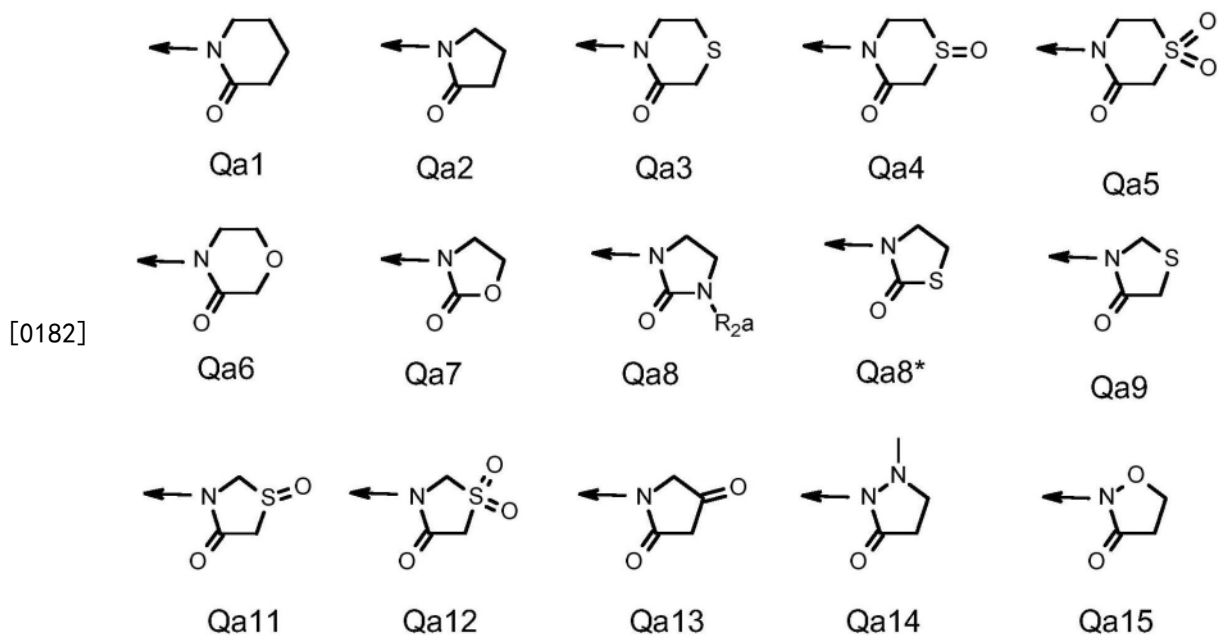
[0177] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-5l) 的化合物,其是具有式 (I-5) 的化合物,其中 $R_4$ 是被选自由以下组成的组的取代基单取代或多取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基:卤素、氰基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、 $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基羰基、 $C_1$ - $C_6$ 二烷基氨基羰基和 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基。

[0178] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-5m) 的化合物,其是具有式 (I-5) 的化合物,其中 $R_4$ 是可以部分饱和或完全饱和的四至六元杂环体系,所述环体系含有1至2个选自O、N、或S(O) $n$ 的环杂原子,其中 $n$ 是0、1或2,其前提是所述杂环体系不含有相邻的氧原子、相邻的硫原子或相邻的硫和氧原子,并且所述氮可以被氢或 $C_1$ - $C_4$ 烷基取代,并且所述环体系可以任选地来自自由以下组成的组单取代或二取代:卤素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基或氧代基。

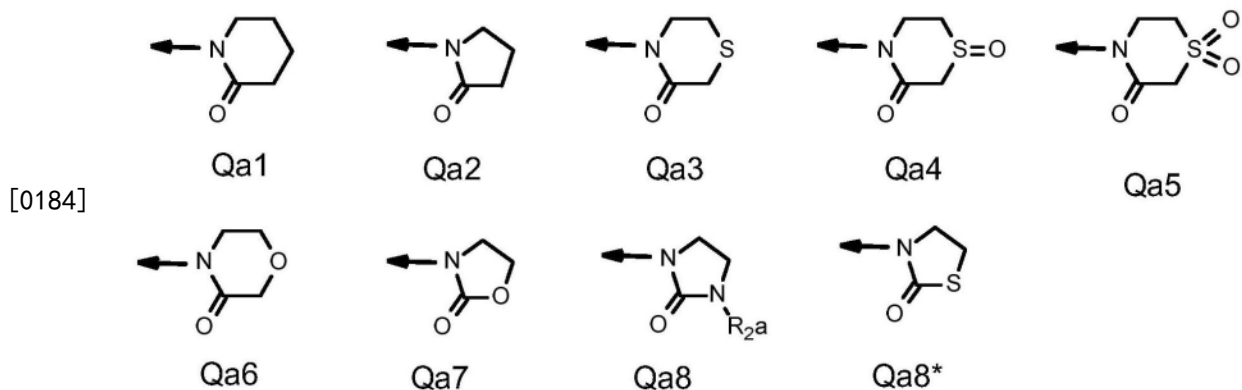
[0179] 在具有式 (I-5a) 至 (I-5m) 的化合物中, $X$ 、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 和 $X_1$ 的优选定义是如对于具有式I(上文)的化合物所定义的。

[0180] 根据此实施例的另一组化合物是具有式 (I-5n) 的化合物,其是具有式 (I-5) 的化合物,其中 $R_3$ 和 $R_4$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成5或6元饱和的五或六元杂环体系,所述杂环体系可以含有一或两个选自O、N、或S(O) $n$ 的额外的杂原子,其中 $n$ 是0、1或2,其前提是所述杂环体系不含有相邻的氧原子、相邻的硫原子或相邻的硫和氧原子,并且所述额外的环氮(当存在时)被氢或 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、或 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷氧基取代,并且其中所述环体系可以任选地被独立地选自以下的取代基单取代或二取代:卤素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基或氧代基;并且

[0181] 在具有式 (I-5n) 的化合物中, $X$ 、 $R_1$ 、 $R_2$ 和 $X_1$ 的优选定义是如对于具有式I(以上)的化合物所定义的,并且优选地, $R_3$ 和 $R_4$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基 $Qa$ ,所述取代基是选自 $Qa1$ 至 $Qa15$ 的基团



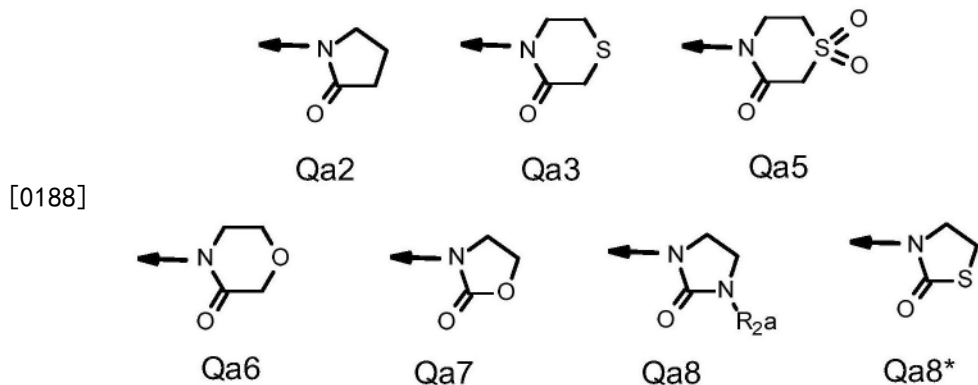
[0183] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点,并且其中每个环体系可以被选自由以下组成的组的取代基单取代或多取代:卤素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、和 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基;其中 $R_{2a}$ 是氢、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、或 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷氧基。最优选地, $R_3$ 和 $R_4$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基Qa,所述取代基是选自Qa1、Qa2、Qa3、Qa4、Qa5、Qa6、Qa7、Qa8和Qa8\*的基团;特别地,取代基Qa是选自Qa1、Qa2、Qa3、Qa4、Qa5和Qa6的基团,



[0185] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点;

[0186] 并且其中 $R_{2a}$ 是氢、 $C_1$ - $C_4$ 烷基或 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基;优选地, $R_{2a}$ 是氢、甲基或甲氧基。

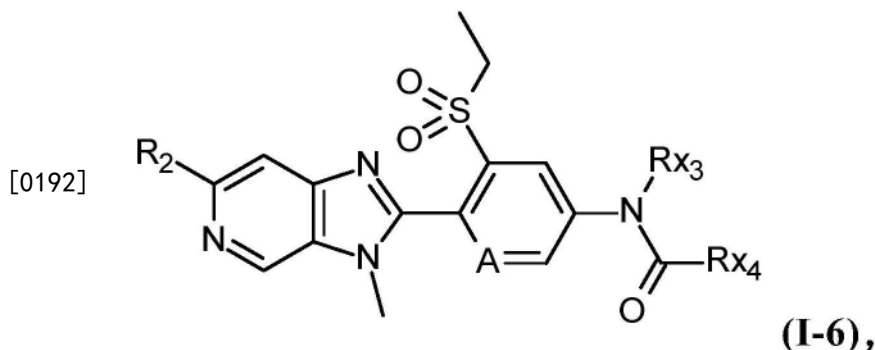
[0187] 甚至更优选地,取代基Qa是选自Qa2、Qa3、Qa5、Qa6、Qa7、Qa8和Qa8\*的基团,



[0189] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点；

[0190] 并且其中 $R_{2a}$ 是氢、 $C_1$ - $C_4$ 烷基或 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基；优选地， $R_{2a}$ 是氢、甲基或甲氧基。

[0191] 根据本发明的一组优选的具有式I的化合物是具有式I-6的那些



[0193] 其中

[0194] A是CH或N、优选地N；

[0195]  $R_2$ 是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、优选三氟甲基；

[0196]  $R_{x_3}$ 是氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基或被氰基单取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基；优选地， $R_{x_3}$ 是氢、甲基、乙基、异丙基、2,2,2-三氟乙基、甲氧基、环丙基或1-氰基环丙基；并且

[0197]  $R_{x_4}$ 是 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 羟基烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基硫基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基或被氰基单取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基；优选地， $R_{x_4}$ 是甲基、乙基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、二氟甲基、氯甲基、2,2,2-三氟乙基、1-羟基-1-甲基-乙基、甲氧基甲基、甲基硫烷基甲基、甲基磺酰基甲基、2-甲基硫烷基乙基、2-甲基磺酰基乙基、1-氰基-1-甲基-乙基、环丙基或1-氰基环丙基；或

[0198] 其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物。

[0199] 根据此实施例的另一组优选的化合物是具有式(I-6a)的化合物，其是具有式(I-6)的化合物，其中， $R_{x_4}$ 是 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 羟基烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基硫基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基或被氰基单取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基；优选地， $R_{x_4}$ 是甲基、乙基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、二氟甲基、氯甲基、2,2,2-三氟乙基、1-羟基-1-甲基-乙基、甲氧基甲基、甲基硫烷基甲基、甲基磺酰基甲基、2-甲基硫烷基乙基、2-甲基磺酰基乙基、1-氰基-1-甲基-乙基、环丙基或1-氰基环丙基。

[0200] 根据此实施例的另一组优选的化合物是具有式(I-6b)的化合物，其是具有式(I-6)的化合物，其中

[0201] A是N；

[0202]  $R_2$ 是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、优选三氟甲基；

[0203]  $R_{x_3}$ 是氢或 $C_1$ - $C_6$ 烷基，优选氢、甲基、乙基或异丙基；并且

[0204]  $R_{x_4}$ 是 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基或 $C_3$ - $C_6$ 环烷基，优选甲基、乙基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、二氟甲基、氯甲基或环丙基。

[0205] 根据此实施例的另一组优选的化合物是具有式(I-6c)的化合物，其是具有式(I-6)的化合物，其中

[0206] A是N;

[0207]  $R_2$ 是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、优选三氟甲基;

[0208]  $R_{x_3}$ 是 $C_1$ - $C_6$ 烷基, 优选甲基、乙基或异丙基; 以及

[0209]  $R_{x_4}$ 是 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基或 $C_3$ - $C_6$ 环烷基, 优选甲基、乙基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、二氟甲基、氯甲基或环丙基。

[0210] 根据此实施例的另一组优选的化合物是具有式(I-6d)的化合物, 其是具有式(I-6)的化合物, 其中

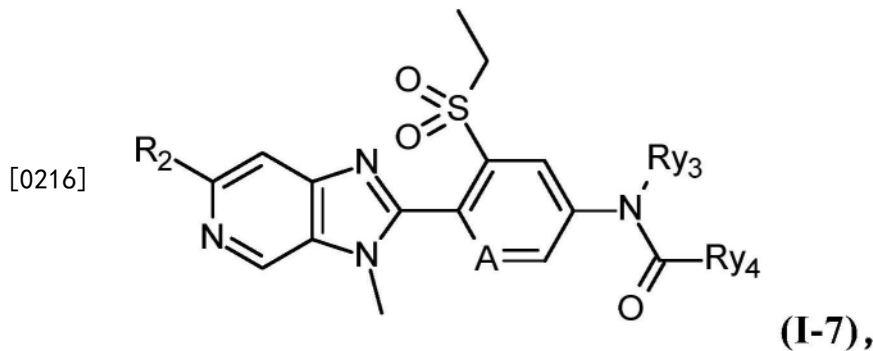
[0211] A是N;

[0212]  $R_2$ 是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、优选三氟甲基;

[0213]  $R_{x_3}$ 是氢; 以及

[0214]  $R_{x_4}$ 是 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基或 $C_3$ - $C_6$ 环烷基, 优选甲基、乙基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、二氟甲基、氯甲基或环丙基。

[0215] 根据本发明的另一组优选的具有式I的化合物是具有式I-7的那些

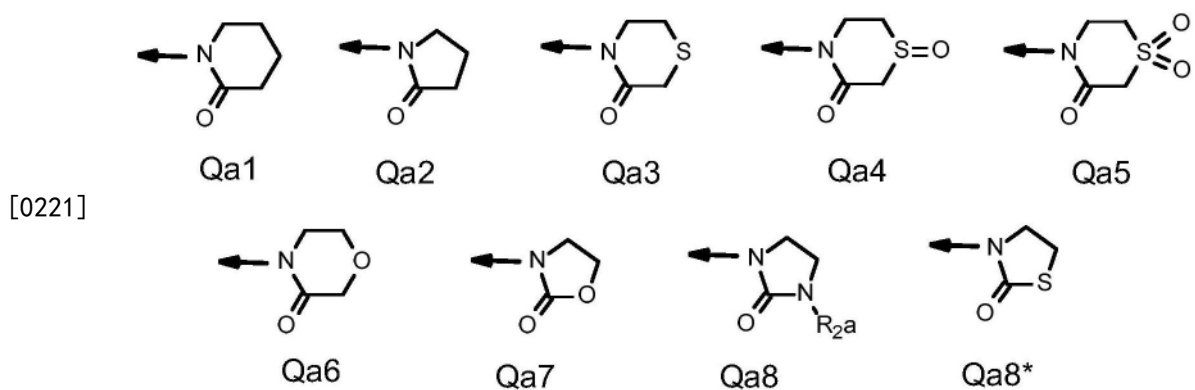


[0217] 其中

[0218] A是CH或N、优选地N;

[0219]  $R_2$ 是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、优选三氟甲基; 并且

[0220]  $R_{y_3}$ 和 $R_{y_4}$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基Qa, 所述取代基是选自Qa1、Qa2、Qa3、Qa4、Qa5、Qa6、Qa7、Qa8和Qa8\*的基团,



[0222] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点;

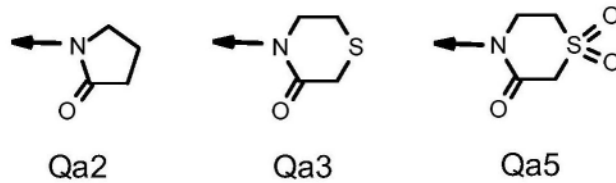
[0223] 并且其中 $R_{2a}$ 是氢、 $C_1$ - $C_4$ 烷基或 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基; 优选地,  $R_{2a}$ 是氢、甲基或甲氧基。

[0224] 根据此实施例的另一组优选的化合物是具有式(I-7a)的化合物, 其是具有式(I-7)的化合物, 其中

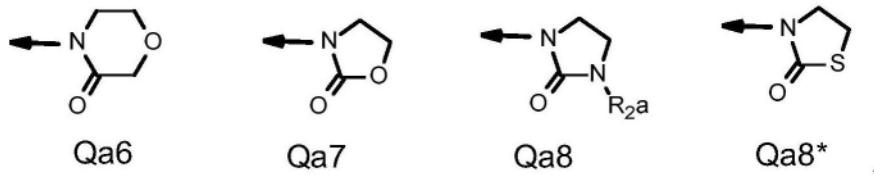
[0225] A是CH或N、优选地N;

[0226]  $R_2$ 是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、优选三氟甲基；并且

[0227]  $R_{y_3}$ 和 $R_{y_4}$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基Qa,所述取代基是选自Qa2、Qa3、Qa5、Qa6、Qa7、Qa8和Qa8\*的基团,



[0228]



[0229] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点；

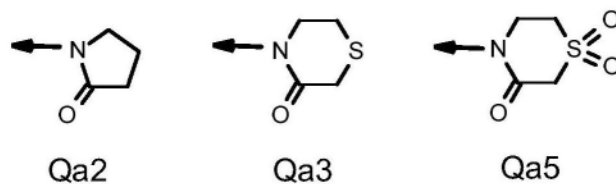
[0230] 并且其中 $R_{2a}$ 是氢、 $C_1$ - $C_4$ 烷基或 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基；优选地, $R_{2a}$ 是氢、甲基或甲氧基。

[0231] 根据此实施例的另一组优选的化合物是具有式(I-7b)的化合物,其是具有式(I-7)的化合物,其中

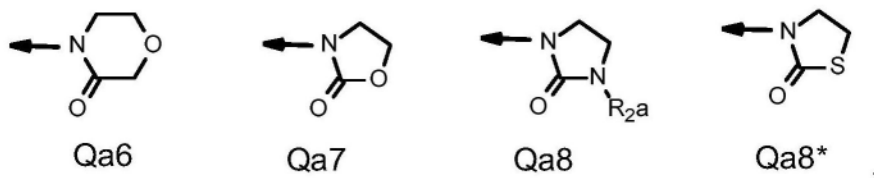
[0232] A是N；

[0233]  $R_2$ 是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、优选三氟甲基；并且

[0234]  $R_{y_3}$ 和 $R_{y_4}$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基Qa,所述取代基是选自Qa2、Qa3、Qa5、Qa6、Qa7、Qa8和Qa8\*的基团,



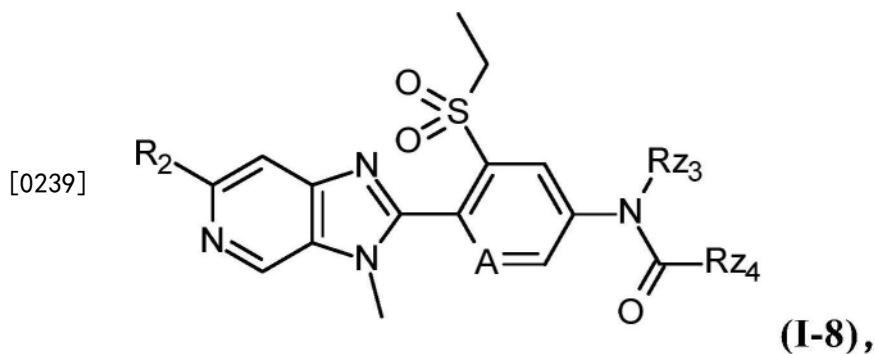
[0235]



[0236] 其中箭头示出了与吡啶基环的附接点；

[0237] 并且其中 $R_{2a}$ 是氢、 $C_1$ - $C_4$ 烷基或 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基；优选地, $R_{2a}$ 是氢、甲基或甲氧基。

[0238] 根据本发明的一组杰出的具有式I的化合物是具有式I-8的那些



[0239]

[0240] 其中

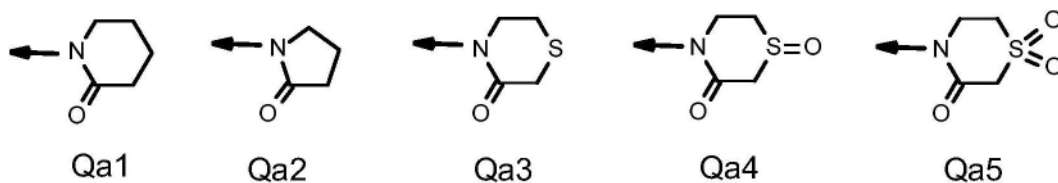
[0241] A是CH或N、优选地N；

[0242]  $R_2$ 是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、优选三氟甲基；

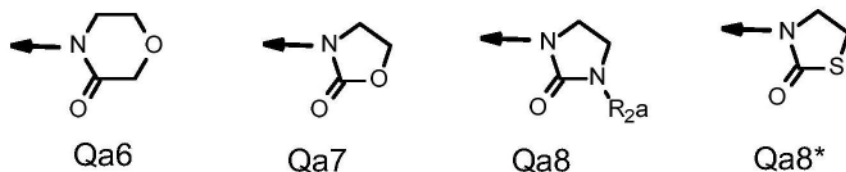
[0243]  $Rz_3$ 是氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基或被氰基单取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基；优选地， $Rz_3$ 是氢、甲基、乙基、异丙基、2,2,2-三氟乙基、甲氧基、环丙基或1-氰基环丙基；

[0244]  $Rz_4$ 是 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 羟基烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基或被氰基单取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基；优选地， $Rz_4$ 是甲基、乙基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、二氟甲基、氯甲基、2,2,2-三氟乙基、1-羟基-1-甲基-乙基、甲氧基甲基、甲基硫烷基甲基、甲基磺酰基甲基、2-甲基硫烷基乙基、2-甲基磺酰基乙基、1-氰基-1-甲基-乙基、环丙基或1-氰基环丙基；或

[0245]  $Rz_3$ 和 $Rz_4$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基Qa，所述取代基是选自Qa1、Qa2、Qa3、Qa4、Qa5、Qa6、Qa7、Qa8和Qa8\*的基团，



[0246]



[0247] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点；

[0248] 并且其中 $R_{2a}$ 是氢、 $C_1$ - $C_4$ 烷基或 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基；优选地， $R_{2a}$ 是氢、甲基或甲氧基；或

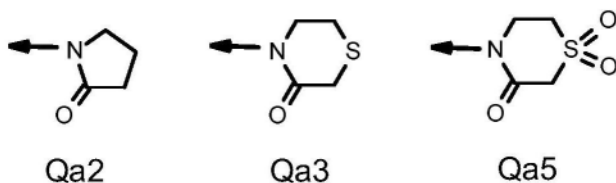
[0249] 其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物。

[0250] 根据此实施例的另一组杰出的化合物是具有式(I-8a)的化合物，其是具有式(I-8)的化合物，其中

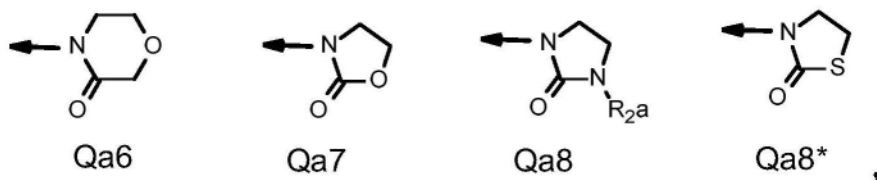
[0251]  $Rz_3$ 是氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基或被氰基单取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基；优选地， $Rz_3$ 是氢、甲基、乙基、异丙基、2,2,2-三氟乙基、甲氧基、环丙基或1-氰基环丙基；

[0252]  $Rz_4$ 是 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 羟基烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基或被氰基单取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基；优选地， $Rz_4$ 是甲基、乙基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、二氟甲基、氯甲基、2,2,2-三氟乙基、1-羟基-1-甲基-乙基、甲氧基甲基、甲基硫烷基甲基、甲基磺酰基甲基、2-甲基硫烷基乙基、2-甲基磺酰基乙基、1-氰基-1-甲基-乙基、环丙基或1-氰基环丙基；或

[0253]  $Rz_3$ 和 $Rz_4$ 与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基Qa，所述取代基是选自Qa2、Qa3、Qa5、Qa6、Qa7、Qa8和Qa8\*的基团，



[0254]

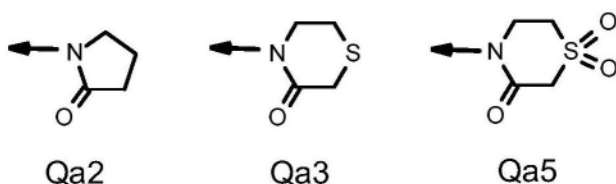


[0255] 其中箭头示出了与苯基或吡啶基环的附接点；

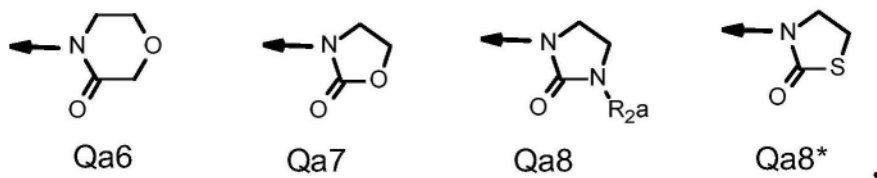
[0256] 并且其中R<sub>2a</sub>是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基；优选地，R<sub>2a</sub>是氢、甲基或甲氧基。

[0257] 根据此实施例的另一组杰出的化合物是具有式(I-8b)的化合物，其是具有式(I-8)的化合物，其中

[0258] A是N；

[0259] R<sub>2</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、优选三氟甲基；[0260] R<sub>z3</sub>是氢或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基，优选氢、甲基、乙基或异丙基；[0261] R<sub>z4</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基，优选甲基、乙基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、二氟甲基、氯甲基或环丙基；或[0262] R<sub>z3</sub>和R<sub>z4</sub>与它们所附接的-NC(O)-片段一起形成取代基Qa，所述取代基是选自Qa2、Qa3、Qa5、Qa6、Qa7、Qa8和Qa8\*的基团，

[0263]



[0264] 其中箭头示出了与吡啶基环的附接点；

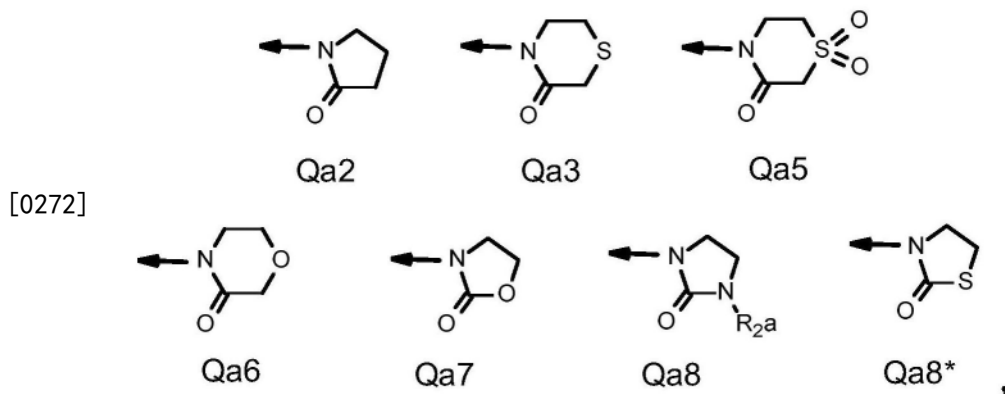
[0265] 并且其中R<sub>2a</sub>是氢、甲基或甲氧基。

[0266] 根据此实施例的另一组杰出的化合物是具有式(I-8c)的化合物，其是具有式(I-8)的化合物，其中

[0267] A是N；

[0268] R<sub>2</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、优选三氟甲基；[0269] R<sub>z3</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基，优选甲基、乙基或异丙基；[0270] R<sub>z4</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基，优选甲基、乙基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、二氟甲基、氯甲基或环丙基；或[0271] R<sub>z3</sub>和R<sub>z4</sub>与NC(O)片段一起形成取代基Qa，所述取代基是选自Qa2、Qa3、Qa5、Qa6、Qa7、Qa8和Qa8\*的基团，





[0273] 其中箭头示出了与吡啶基环的附接点；

[0274] 并且其中 $R_{2a}$ 是氢、甲基或甲氧基。

[0275] 根据此实施例的另一组杰出的化合物是具有式 (I-8d) 的化合物, 其是具有式 (I-8) 的化合物, 其中

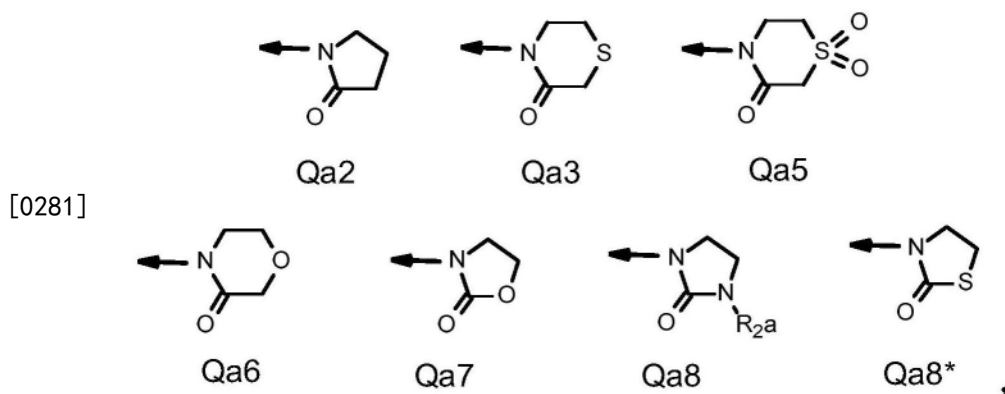
[0276] A是N;

[0277]  $R_2$ 是 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、优选三氟甲基;

[0278]  $R_{z3}$ 是氢;

[0279]  $R_{z4}$ 是 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基或 $C_3$ - $C_6$ 环烷基, 优选甲基、乙基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、二氟甲基、氯甲基或环丙基; 或

[0280]  $R_{z3}$ 和 $R_{z4}$ 与-NC(O)-片段一起形成取代基Qa, 所述取代基是选自Qa2、Qa3、Qa5、Qa6、Qa7、Qa8和Qa8\*的基团,



[0282] 其中箭头示出了与吡啶基环的附接点；

[0283] 并且其中 $R_{2a}$ 是氢、甲基或甲氧基。

[0284] 根据本发明的化合物可以具有任何数量的益处, 尤其包括对于保护植物抵抗昆虫的有利水平的生物活性或对于用作农用化学品活性成分的优越特性 (例如, 更高的生物活性、有利的活性谱、增加的安全性、改进的物理-化学特性、或增加的生物可降解性或环境特征曲线)。具体而言, 已经出人意料地发现某些具有式 (I) 的化合物相对于非靶标节肢动物特别是传粉者 (如蜜蜂、独居蜂和熊蜂) 可以显示出有利的安全性。最特别地, 相对于意大利蜂 (*Apis mellifera*)。

[0285] 在另一个方面, 本发明提供了一种组合物, 所述组合物包含杀昆虫、杀螨、杀线虫、或杀软体动物有效量的如在实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18或19 (上文) 中任一项或具有式 (I-1)、(I-1-1)、(I-2)、(I-3)、(I-4)、(I-5)、(I-6)、(I-7) 和

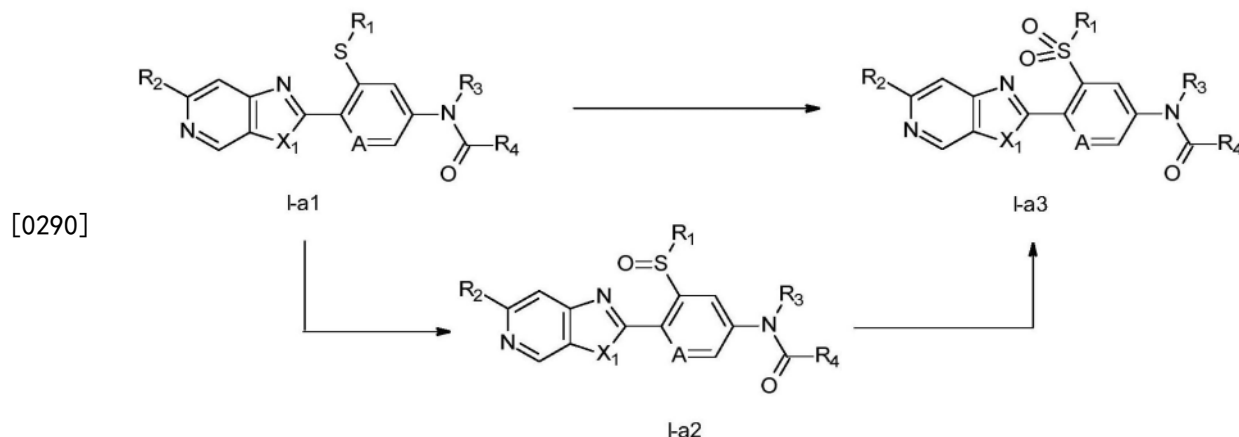
(I-8)的化合物的实施例中任一项所定义的具有式(I)的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,以及任选地,助剂或稀释剂。

[0286] 在另一个方面,本发明提供一种对抗并控制昆虫、螨、线虫或软体动物的方法,所述方法包括向有害生物、有害生物的场所、或易受有害生物攻击的植物施用杀昆虫、杀螨、杀线虫、或杀软体动物有效量的如在实施例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18或19(上文)中任一项或具有式(I-1)、(I-1-1)、(I-2)、(I-3)、(I-4)、(I-5)、(I-6)、(I-7)和(I-8)的化合物的实施例(上文)中任一项所定义的具有式(I)的化合物,或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,或如上文所定义的组合物。

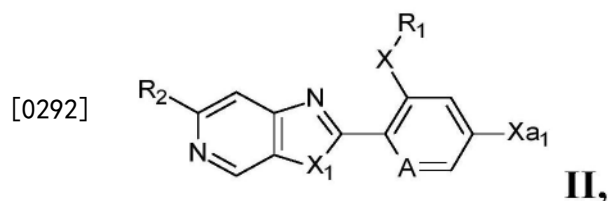
[0287] 在又另一方面,本发明提供一种用于保护植物繁殖材料免受昆虫、螨、线虫或软体动物攻击的方法,该方法包括用如上文所定义的组合物处理所述繁殖材料或所述繁殖材料所种植的场所。

[0288] 根据本发明的用于制备具有式I的化合物的方法通过本领域技术人员已知的方法进行。具有式I-a3的化合物(其中X是SO<sub>2</sub>,并且A、X<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>和R<sub>4</sub>是如上文在式I下所定义的)可以通过氧化具有式I-a2的化合物(其中X是SO,并且A、X<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>和R<sub>4</sub>是如上文在式I下所定义的)来制备。所述反应可以用例如过酸(例如过乙酸或间氯过苯甲酸)、或氢过氧化物(例如像过氧化氢或叔丁基氢过氧化物)、或无机氧化剂(如单过氧二硫酸盐或高锰酸钾)的试剂进行。以类似方式,具有式I-a2的化合物(其中X是SO,并且A、X<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>和R<sub>4</sub>是如上文在式I下所定义的)可以在如上所述的类似条件下通过氧化具有式I-a1的化合物(其中X是S,并且A、X<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>和R<sub>4</sub>是如上文在式I下所定义的)来制备。这些反应可以在与这些条件相容的各种有机或水性溶剂中,通过从低于0°C直至溶剂体系的沸点的温度进行。具有式I-a1的化合物向具有式I-a2和I-a3的化合物的转化在方案1中示出。

[0289] 方案1

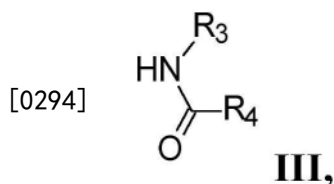


[0291] 具有式I的化合物可以由具有式II的化合物,



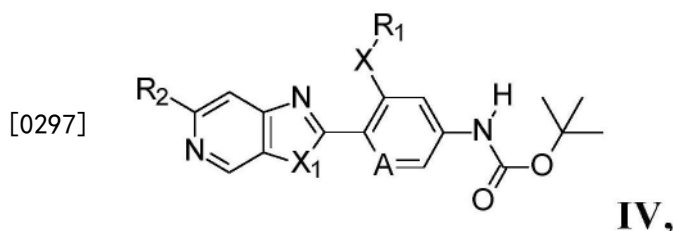
[0293] 其中R<sub>2</sub>、X<sub>1</sub>、X、R<sub>1</sub>和A是如在具有式I的化合物中描述的并且Xa1是卤素(或拟卤素离

去基团,如三氟甲磺酸酯),优选碘、溴或氯,通过用具有式III的化合物



[0295] 其中R<sub>3</sub>和R<sub>4</sub>是如在式I中描述的,任选地在碱(如碳酸钾、碳酸铯、氢氧化钠)的存在下,在惰性溶剂(如甲苯、二甲基甲酰胺DMF、N-甲基吡咯烷、二甲亚砜DMSO、二噁烷、四氢呋喃THF等)中,任选地在催化剂(例如乙酸钯(II)、双(二亚苺基丙酮)钯(0)(Pd(dba)<sub>2</sub>)或三(二亚苺基丙酮)二钯(0)(Pd<sub>2</sub>(dba)<sub>3</sub>,任选地呈氯仿加合物的形式)或钯预催化剂(例如像tert-BuBrettPhos Pd G3[(2-二-叔丁基膦基-3,6-二甲氧基-2',4',6'-三异丙基-1,1'-联苯基)-2-(2'-氨基-1,1'-联苯基)]甲磺酸钯(II)或BrettPhos Pd G3[(2-二-环己基膦基-3,6-二甲氧基-2',4',6'-三异丙基-1,1'-联苯基)-2-(2'-氨基-1,1'-联苯基)]甲磺酸钯(II))的存在下,并且任选地在配体(例如SPhos、t-BuBrettPhos或Xantphos)的存在下,在60°C-120°C之间的温度下,任选地在微波辐射下进行处理来制备。此类反应在文献中是已知的,并且已经报道于,例如Tetrahedron[四面体],2009,65,6576,Org.Lett.[有机快报]2013,15,2876以及J.Am.Chem.Soc.[美国化学会志]2009,131,16720中。

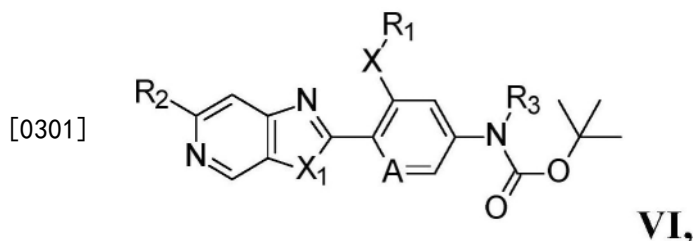
[0296] 可替代地(参见方案2的概述),具有式I的化合物可以通过用氨基甲酸叔丁酯H<sub>2</sub>NC(O)Ot-Bu在与上述那些类似的条件下处理具有式II的化合物而获得。类似的反应在文献中也有先例,例如在Green Chemistry[绿色化学],16(3),1480-1488;2014中。如此获得的具有式IV的化合物,



[0298] 其中,R<sub>2</sub>、X<sub>1</sub>、X、R<sub>1</sub>和A是如在具有式I的化合物中描述的,可以用具有式V的化合物

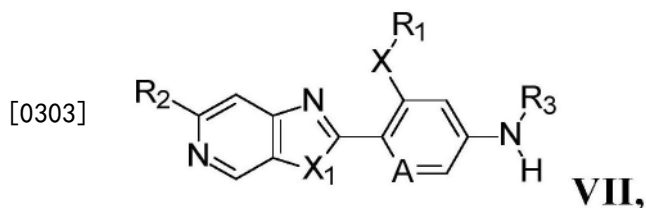


[0300] 其中R<sub>3</sub>是如在式I下描述的,并且其中Xa<sub>2</sub>是离去基团如卤素,优选碘、溴或氯(或拟卤素离去基团,如(卤代)烷基或苯基磺酸酯,例如三氟甲磺酸酯),在碱(如氢氧化钠或碱土金属氢化物、碳酸盐(例如碳酸钠、碳酸钾或碳酸铯)或氢氧化物)的存在下,在惰性溶剂(如四氢呋喃、二噁烷、二甲基甲酰胺DMF、N,N-二甲基乙酰胺或乙腈等)中,在0°C与120°C之间的温度下,通过本领域技术人员熟知的程序烷基化,以给出具有式VI的化合物

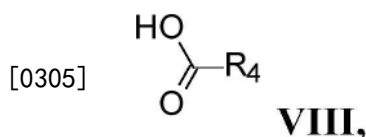


[0302] 其中R<sub>2</sub>、X<sub>1</sub>、X、R<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>和A是如在具有式I的化合物中描述的。具有式VI的化合物可以

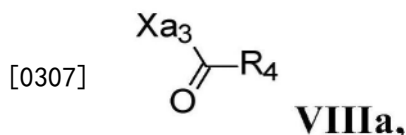
通过在惰性溶剂(如二氯甲烷或四氢呋喃THF)中,任选地在水的存在下,在0°C与80°C之间的温度下,通过本领域技术人员熟知的方法,用有机酸(例如三氟乙酸、乙酸等),或无机酸如盐酸处理转化成具有式VII的化合物



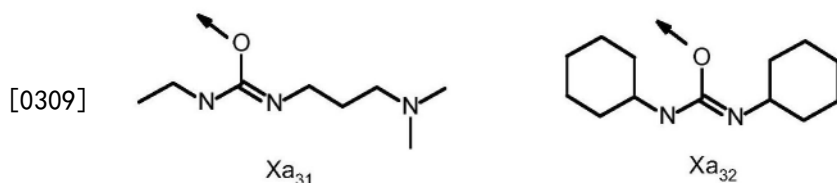
[0304] 其中R<sub>2</sub>、X<sub>1</sub>、X、R<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>和A是如在具有式I的化合物中描述的。如此获得的具有式VII的化合物可以通过用具有式VIII的化合物处理转化成具有式I的化合物,



[0306] 其中R<sub>4</sub>是如在式I中描述的。为了实现这样的反应,具有式VIII的化合物需要通过本领域技术人员已知的并且描述于,例如Tetrahedron[四面体], 61 (46), 10827-10852, 2005的方法活化成具有式VIIIa的化合物

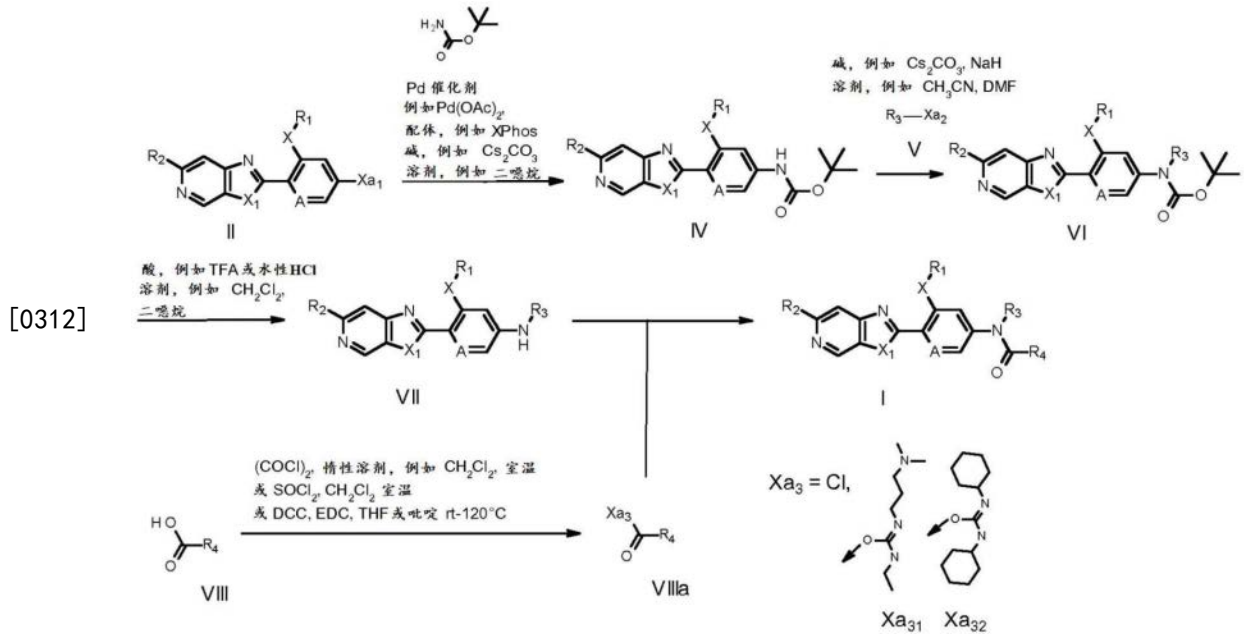


[0308] 其中R<sub>4</sub>是如在式I中描述的,并且其中Xa<sub>3</sub>是卤素、优选氯。例如,通过在催化量的N,N-二甲基甲酰胺(DMF)存在下,在惰性溶剂(如二氯甲烷或四氢呋喃THF)中,在20°C至100°C之间的温度(优选25°C)下,用例如草酰氯(COCl)<sub>2</sub>或亚硫酰氯SOCl<sub>2</sub>处理VIII来形成化合物VIIIa(其中Xa<sub>3</sub>是卤素,优选氯)。可替代地,具有式VIIIa的化合物可以通过在惰性溶剂(例如吡啶或四氢呋喃THF)中,任选地在碱(例如三乙胺)的存在下,在50°C-180°C之间的温度下用1-乙基-3-(3-二甲基氨基丙基)碳二亚胺(EDC)或二环己基碳二亚胺(DCC)处理具有式VIII的化合物,以给出活化的物种VIIIa(其中Xa<sub>3</sub>分别是Xa<sub>31</sub>或Xa<sub>32</sub>,



[0310] 其中箭头表示与基团COR<sub>4</sub>的附接点)来制备。在碱(如三乙胺,N,N-二异丙基乙胺或吡啶)的存在下,任选地在催化剂(如4-二甲基氨基吡啶DMAP)的存在下,在惰性溶剂(如二氯甲烷、四氢呋喃、二噁烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈、乙酸乙酯或甲苯)中,在0°C与50°C之间的温度下,用具有式VII的化合物(其中R<sub>2</sub>、X<sub>1</sub>、X、R<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>和A是如在式I中所定义的)处理活化的物种VIIIa(其中R<sub>4</sub>是如在式I中所定义的),然后将形成具有式I的化合物。某些碱(如吡啶和三乙胺)可以成功地用作碱和溶剂两者。方案2中概述了具有式I的化合物的此替代合成。

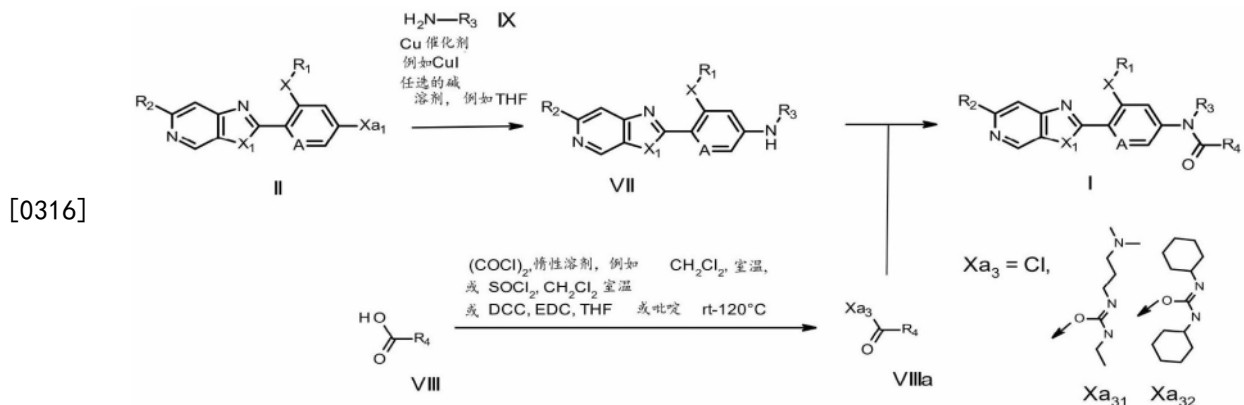
[0311] 方案2



[0313] 可替代地, 具有式I的化合物可以在例如磷酰氯的存在下, 同时包括碱(如吡啶和三乙胺, 其同时起到碱和溶剂/稀释剂的作用), 在 $-30^\circ\text{C}$ 与 $60^\circ\text{C}$ 之间(优选地, 在 $-20^\circ\text{C}$ 与室温之间)的温度下, 通过使具有式VII的化合物与具有式VIII的化合物直接反应来制备。

[0314] 方案3中说明了具有式I的化合物的另外的合成。

[0315] 方案3



[0317] 如方案3所示, 将具有式II的化合物(其中 $\text{R}_2, \text{X}_1, \text{X}, \text{R}_1$ 和A是如在具有式I的化合物中描述的并且 $\text{Xa}_1$ 是卤素(或拟卤素离去基团, 如三氟甲磺酸酯), 优选碘、溴或氯)用具有式IX的化合物

[0318]  $\text{H}_2\text{N}-\text{R}_3$  IX,

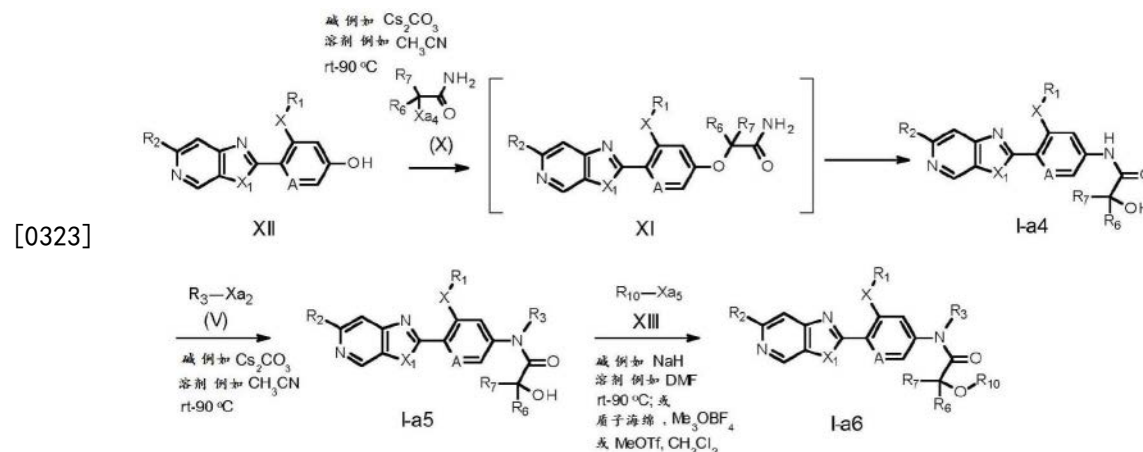
[0319] 或其盐(如氢卤化物盐, 优选盐酸盐或氢溴酸盐、或三氟乙酸盐、或任何其他等效盐), 其中 $\text{R}_3$ 是如在式I下所定义的, 在铜催化剂(如铜粉、碘化铜(I)或硫酸铜(任选地呈水合物的形式)、或其混合物)的存在下, 在惰性溶剂(如醇、酰胺、酯、醚、腈和水, 特别优选的是甲醇、乙醇、2,2,2-三氟乙醇、丙醇、异丙醇、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二噁烷、四氢呋喃、二甲氧基乙烷、乙腈、乙酸乙酯、水或其混合物)中, 在 $0^\circ\text{C}$ - $150^\circ\text{C}$ 之间的温度(优选地, 在范围从室温至反应混合物的沸点的温度)下, 任选地在微波辐射或使用高压釜的加压条件下, 任选地在碱的存在下处理产生具有式VII的化合物(其中 $\text{R}_2, \text{X}_1, \text{X}, \text{R}_1, \text{R}_3$ 和A

是如在式I中所定义的)。此反应在文献中是熟知的(称为乌尔曼(Ullmann)反应或围绕这种类型的反应的变型),参见例如Coord.Chem.Rev.[配位化学评述]2004,248,2337-2364,Tetrahedron[四面体],67(29),5282-5288;2011,Angew.Chem.,Int.Ed.[应用化学国际版]2003,42,5400-5449;Synlett[合成快报]2003,2428-2439;或Ind.Eng.Chem.Res.[工业与工程化学研究]2005,44,789-798。所述反应通常用一或两当量的碱(如磷酸钾),在铜催化剂(例如碘化铜(I)、硫酸铜、或铜)的存在下并且在含氧气氛下进行。所述反应可以在惰性溶剂(像二噁烷、THF、或甲苯)中,通常在50°C至150°C之间的温度下,并且任选地在额外的配体(例如二胺配体(例如反式-环己基二胺)或二亚苺基丙酮(dba),或1,10-菲咯啉)的存在下进行。

[0320] 将具有式VII的化合物用具有式VIIIa的化合物(可替代地,在化合物VII与化合物VIII之间的直接反应)在方案2中描述的条件下酰化产生具有式I的化合物。

[0321] 对于化合物I-a4、I-a5和I-a6的特定子组,方案4中说明了具有式I的化合物的另外的合成,其中A、X、X<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>和R<sub>3</sub>是如在I下所定义的,并且其中R<sub>6</sub>和R<sub>7</sub>独立地是氢或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基,并且其中R<sub>10</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基。

[0322] 方案4



[0324] 具有式XI的化合物(方案4)(其中A、X、X<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>和R<sub>2</sub>是如在式I中所定义的,并且其中R<sub>6</sub>和R<sub>7</sub>独立地是氢或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)可以通过具有式XII的化合物(其中A、X、X<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>和R<sub>2</sub>是如在式I中所定义的)与具有式(X)的化合物(其中R<sub>6</sub>和R<sub>7</sub>独立地是氢或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基,并且其中Xa4是离去基团如卤素,优选碘、溴或氯),在碱(例如氢氧化钠、氢化钠、碳酸钠、叔丁醇钾、氢氧化钾、碳酸钾或碳酸铯)的存在下,在惰性溶剂(如二甲基甲酰胺DMF、乙腈、二甲亚砜DMSO等)中,在20°C-180°C之间(优选地,室温至90°C)的温度下反应来制备。

[0325] 具有式XI的化合物可以被分离,或通过延长的反应时间重排为具有式I的化合物、相应地具有式I-a4的化合物,其中A、X、X<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>和R<sub>2</sub>是如在式I中所定义的,并且其中R<sub>6</sub>和R<sub>7</sub>独立地是氢或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基。此反应被称为斯迈尔斯(Smiles)重排,并且在文献(例如Organic Reactions[有机反应].18:99-215,2011和其中引用的参考文献)中有很好的先例。

[0326] 具有式I-a5的化合物(其中A、X、X<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>和R<sub>3</sub>是如在式I中所定义的,并且其中R<sub>6</sub>和R<sub>7</sub>独立地是氢或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)可以通过具有式I-a4的化合物(其中A、X、X<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>和R<sub>2</sub>是如在式I中所定义的,并且其中R<sub>6</sub>和R<sub>7</sub>独立地是氢或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)与具有式R<sub>3</sub>-Xa2(V)的化合物(其中R<sub>3</sub>是如在式I中所定义的,并且其中Xa2是离去基团如卤素,优选碘、溴或氯(或拟卤素离去基团,

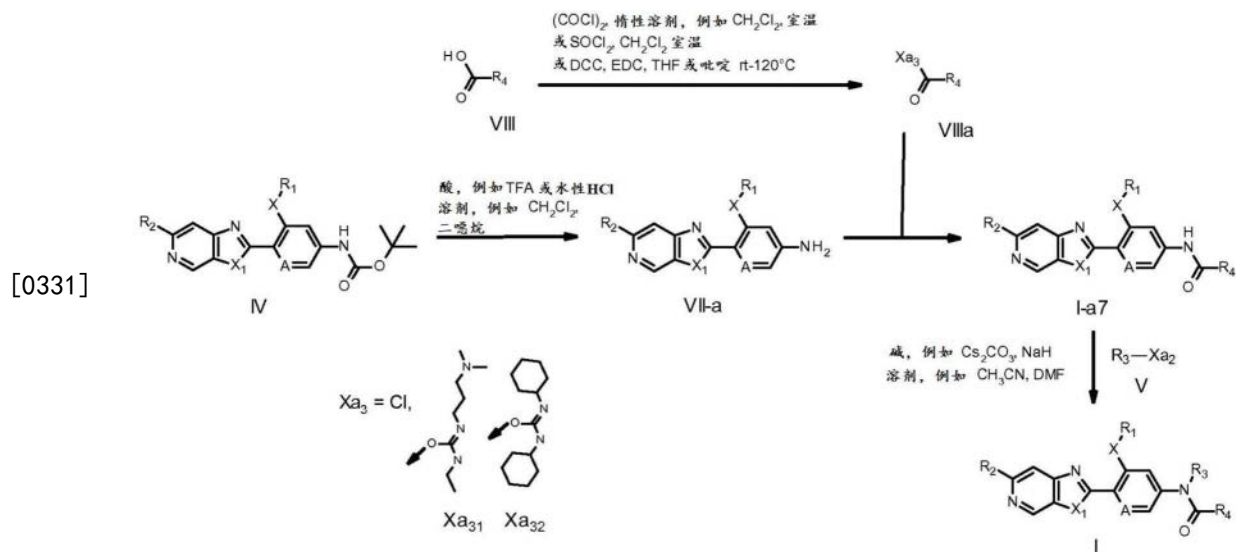
如(卤代)烷基或苯基磺酸酯,例如三氟甲磺酸酯),在碱(如碳酸钠、碳酸钾或碳酸铯、或氢氧化钠)的存在下,在合适的溶剂(如例如四氢呋喃、二噁烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺或乙腈)中,在0°C与150°C之间的温度下,通过本领域技术人员已知的方法反应来制备。

[0327] 具有式I-a5的化合物(其中A、X、X<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>和R<sub>3</sub>是如在式I中所定义的,并且其中R<sub>6</sub>和R<sub>7</sub>独立地是氢或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)可以进而通过与具有式XIII的化合物(其中R<sub>10</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基,并且其中Xa5是离去基团如卤素,优选碘、溴或氯(或拟卤素离去基团,如(卤代)烷基或苯基磺酸酯,例如三氟甲磺酸酯),在碱(如碳酸钠、碳酸钾或碳酸铯、或氢氧化钠)的存在下,在合适的溶剂(如例如四氢呋喃、二噁烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺或乙腈)中,在0°C与150°C之间的温度下,通过本领域技术人员已知的方法反应,被进一步烷基化为具有式I-a6的化合物(其中A、X、X<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>和R<sub>3</sub>是如在式I中所定义的,并且其中R<sub>6</sub>和R<sub>7</sub>独立地是氢或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基,并且其中R<sub>10</sub>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)。

[0328] 可替代地,并且在其中R<sub>10</sub>是甲基的特定情况下,可能有利的是通过使用Evans, D.A.; Ratz, Andrew M.; Huff, Bret E.; Sheppard, George S.在Tet.Lett.[四面体快报](1994), 35(39), 7171-2中描述的方法将具有式I-a5的化合物的氧烷基化,所述方法在惰性溶剂(如二氯甲烷)中利用质子海绵和亲电子甲基源,如三氟甲磺酸甲酯(MeOTf)和三甲基氧鎓氟硼酸盐(Me<sub>3</sub>OBF<sub>4</sub>)。

[0329] 可替代地,具有式I的化合物(其中X、A、X<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>和R<sub>4</sub>是如上所定义的),

[0330] 方案5



[0332] 可以通过使具有式I的化合物(其中R<sub>3</sub>是氢,定义具有式I-a7的化合物(其中X、A、X<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>和R<sub>4</sub>是如在式I中所定义的))与具有式R<sub>3</sub>-Xa2(V)的化合物(其中R<sub>3</sub>是如在式I中所描述的,并且其中Xa2是离去基团如卤素,优选碘、溴或氯(或拟卤素离去基团,如(卤代)烷基或苯基磺酸酯,例如三氟甲磺酸酯),在碱(如氢氧化钠或碱土金属氢化物,碳酸盐(例如碳酸钠、碳酸钾或碳酸铯)或氢氧化物)的存在下,在惰性溶剂(如四氢呋喃、二噁烷、N,N-二甲基甲酰胺DMF、N,N-二甲基乙酰胺或乙腈等)中,在0°C与120°C之间的温度下,通过本领域技术人员熟知的程序反应来制备(方案5)。

[0333] 具有式I-a7的化合物(其中X、A、X<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>和R<sub>4</sub>是如在式I中所定义的)可以通过使

具有式VII的化合物(其中 $R_3$ 是氢,定义具有式VII-a的化合物(其中X、A、 $X_1$ 、 $R_1$ 和 $R_2$ 是如在式I中所定义的))与具有式VIIIa的化合物(其中 $R_4$ 是如在式I中所描述的,并且其中 $Xa_3$ 是卤素,优选氯)通过本领域技术人员已知的且已经在以上方案2中描述的方法反应来制备。可替代地,具有式I-a7的化合物可以通过使具有式VII-a的化合物直接与具有式VIII的化合物在已经在以上方案2中描述的条件下反应来制备。

[0334] 具有式VII-a的化合物(其中X、A、 $X_1$ 、 $R_1$ 和 $R_2$ 是如在式I中所定义的)可以通过使具有以上描述的式IV的化合物(其中X、A、 $X_1$ 、 $R_1$ 和 $R_2$ 是如在式I中所定义的)与有机酸(例如三氟乙酸、乙酸等),或无机酸如盐酸,在已经在以上方案2中描述的条件(将化合物VI转化为化合物VII)下反应来制备。

[0335] 具有式II的化合物(其中 $R_2$ 、 $X_1$ 、X、 $R_1$ 和A是如在式I中所描述的,并且 $Xa_1$ 是卤素,优选碘、溴或氯)已经描述于文献中,例如2-(5-溴-3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶([CAS1643557-78-1],WO 2016030229,WO 2016026848,WO 2016005263,WO 2015000715);2-(5-溴-3-乙基亚磺酰基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶([CAS1643557-82-7],WO 2015000715);2-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶([CAS1643557-84-9],WO 2016091731,WO 2016030229,WO 2016026848,WO 2016005263,WO 2015000715);2-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基硫烷基)咪唑并[4,5-c]吡啶([CAS1961308-33-7],WO 2016107831);2-[5-氯-3-(乙硫基)-2-吡啶基]-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶(CAS 1643557-79-2,WO 2015000715);2-[5-氯-3-(乙基磺酰基)-2-吡啶基]-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶(CAS1643557-85-0,WO 2015000715);2-[4-溴-2-(乙硫基)苯基]-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶(CAS[1643557-99-6],WO 2018153778,WO 2016030229,WO 2016026848,WO 2015000715);2-[4-溴-2-(乙基磺酰基)苯基]-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶(CAS[1643558-05-7],WO 2016091731,WO 2016030229,WO 2016026848,WO 2016023954,WO 2015000715)。

[0336] 具有式XII的化合物(其中A、X、 $X_1$ 、 $R_1$ 和 $R_2$ 是如在式I中所定义的)已经描述于文献中,例如5-(乙硫基)-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶酚(CAS [1643139-97-2],WO 2016091731,WO 2015000715);5-(乙基磺酰基)-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶酚(CAS[2248422-79-7],WO 2018197315);3-(乙基磺酰基)-4-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-苯酚(CAS[2248422-88-8],WO 2018197315)。

[0337] 具有式III的化合物,其中 $R_3$ 和 $R_4$ 是如在式I中所描述的;以及

[0338] 具有式V的化合物,其中 $R_3$ 是如在式I下所描述的,并且其中 $Xa_2$ 是离去基团如卤素,优选碘、溴或氯(或拟卤素离去基团,如(卤代)烷基或苯基磺酸酯,例如三氟甲磺酸酯);以及

[0339] 具有式VIII的化合物,其中 $R_4$ 是如在式I中所描述的;以及

[0340] 具有式VIIIa的化合物,其中 $R_4$ 是如在式I中所描述的,并且其中 $Xa_3$ 是卤素,优选氯;以及

[0341] 具有式IX的化合物或其盐(如氢卤化物盐,优选盐酸盐或氢溴酸盐、或三氟乙酸盐、或任何其他等效盐),其中 $R_3$ 是如在式I下所定义的;以及



[0342] 具有式(X)的化合物,其中 $R_6$ 和 $R_7$ 独立地是氢或 $C_1$ - $C_4$ 烷基,并且其中Xa4是离去基团如卤素,优选碘、溴或氯;以及

[0343] 具有式XIII的化合物(其中 $R_{10}$ 是 $C_1$ - $C_4$ 烷基,并且其中Xa5是离去基团如卤素,优选碘、溴或氯;

[0344] 是已知的、可商购的或者可以通过本领域技术人员已知的方法来制备。

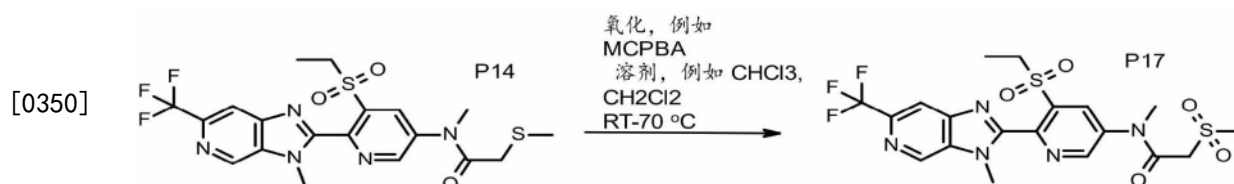
[0345] 这些反应物可以在碱的存在下进行反应。适合的碱的实例是碱金属或碱土金属氢氧化物、碱金属或碱土金属氢化物、碱金属或碱土金属酰胺、碱金属或碱土金属醇盐、碱金属或碱土金属乙酸盐、碱金属或碱土金属碳酸盐、碱金属或碱土金属二烷基酰胺或碱金属或碱土金属烷基甲硅烷基酰胺、烷基胺、亚烷基二胺、游离的或N-烷基化的饱和或不饱和的环烷基胺、碱性杂环、氢氧化铵以及碳环胺。可以提及的实例是氢氧化钠、氢化钠、氨基钠、甲醇钠、乙酸钠、碳酸钠、叔丁醇钾、氢氧化钾、碳酸钾、氢化钾、二异丙氨基锂、双(三甲硅烷基)酰胺钾、氢化钙、三乙胺、二异丙基乙胺、三亚乙基二胺、环己胺、N-环己基-N,N-二甲胺、N,N-二乙苯胺、吡啶、4-(N,N-二甲基氨基)吡啶、奎宁环、N-甲基吗啉、苄基三甲铵氢氧化物以及1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯(DBU)。

[0346] 这些反应物可以按照原样彼此进行反应,即:不添加溶剂或稀释剂。然而,在大多数情况下,加入惰性溶剂或稀释剂或这些的混合物是有利的。如果所述反应在碱的存在下进行,那么这些过量使用的碱(如三乙胺、吡啶、N-甲基吗啉或N,N-二乙苯胺)还可以充当溶剂或稀释剂。

[0347] 这些反应有利地在从约 $-80^{\circ}\text{C}$ 到约 $+140^{\circ}\text{C}$ 、优选从约 $-30^{\circ}\text{C}$ 到约 $+100^{\circ}\text{C}$ 的温度范围内,在许多情况下在环境温度与约 $+80^{\circ}\text{C}$ 之间的范围内进行。

[0348] 通过以常规方式用根据本发明的一个或多个其他取代基取代具有式I的起始化合物的一个或多个取代基,并通过用反应(如氧化、烷基化、还原、酰化和本领域技术人员已知的其他方法)对化合物进行后修饰,可以将具有式I的化合物以本身已知的方式转化成另一种具有式I的化合物。此种反应的实例在下文(方案6)中示出,其为在如方案1中描述的条件下,通过氧化将具有式I的化合物(P14)转化为另外的具有式I的化合物(P17)。

[0349] 方案6



[0351] 取决于所选的适合各自情况的反应条件以及起始材料,有可能例如,在一个反应步骤中仅将一个取代基用根据本发明的另一个取代基替代,或者在同一个反应步骤中可以将多个取代基用根据本发明的其他取代基来替代。

[0352] 具有式I的化合物的盐能以本身已知的方式来制备。因此,例如,具有式I的化合物的酸加成盐是通过用适合的酸或适合的离子交换剂试剂进行处理来获得的,并且与碱的盐是通过用适合的碱或用适合的离子交换剂试剂进行处理来获得的。

[0353] 具有式I的化合物的盐能以常规方式转化为游离的化合物I、酸加成盐(例如通过用适合的碱性化合物或用适合的离子交换剂试剂进行处理)以及与碱的盐(例如通过用适合的酸或用适合的离子交换剂试剂进行处理)。

[0354] 具有式I的化合物的盐能以本身已知的方式转化为具有式I的化合物的其他盐、酸加成盐,例如转化成其他酸加成盐,例如通过在适合的溶剂中用酸的适合的金属盐(如钠、钡或银的盐,例如用乙酸银)来处理无机酸的盐(如盐酸盐),在所述溶剂中,所形成的无机盐(例如氯化银)是不溶的并且因此从所述反应混合物中沉淀出。

[0355] 取决于程序或反应条件,具有成盐特性的这些具有式I的化合物能以游离形式或盐的形式获得。

[0356] 取决于分子中存在的不对称碳原子的数目、绝对和相对构型和/或取决于分子中存在的非芳香族双键的构型,具有式I的化合物和适当时其互变异构体(在每种情况下呈游离形式或呈盐形式)可以以可能的异构体之一的形式或作为这些的混合物存在,例如以纯异构体的形式,如对映体和/或非对映体,或作为异构体混合物,如对映异构体混合物,例如外消旋体、非对映体混合物或外消旋体混合物存在;本发明涉及纯异构体以及还有所有可能的异构体混合物,并且在上文和下文中在每种情况下都应如此理解,即使立体化学细节未在每种情况下明确提及。

[0357] 呈游离形式或呈盐形式的具有式I的化合物的非对映异构体混合物或外消旋体混合物(它们的获得可以取决于已选定的起始材料和程序)能够在这些组分的物理化学差异的基础上,例如通过分步结晶、蒸馏和/或色谱法以已知的方式分离成纯的非对映异构体或外消旋体。

[0358] 能够以类似方式获得的对映异构体混合物(如外消旋体)可以通过已知方法拆分成光学对映体,例如通过从光学活性溶剂再结晶;通过在手性吸附剂上的色谱法,例如在乙酰纤维素上的高效液相色谱法(HPLC);借助于适合的微生物,通过用特异性固定化酶裂解;通过形成包含化合物,例如使用手性冠醚,其中仅一个对映异构体被络合;或通过转化成非对映异构体的盐,例如通过使碱性最终产物外消旋体与光学活性酸(如羧酸,例如樟脑酸、酒石酸或苹果酸,或磺酸,例如樟脑磺酸)反应,并且分离能够以此方式获得的非对映异构体混合物,例如基于其不同溶解度通过分步结晶,从而获得非对映异构体,从所述非对映异构体可以通过适合的试剂(例如碱性试剂)的作用使所希望的对映异构体变成游离的。

[0359] 纯的非对映异构体或对映异构体可以根据本发明来获得,不仅是通过分离适合的异构体混合物,还可以是通过普遍已知的非对映立体选择性或对映选择性合成的方法,例如通过根据本发明用具有适合的立体化学的起始材料进行所述方法。

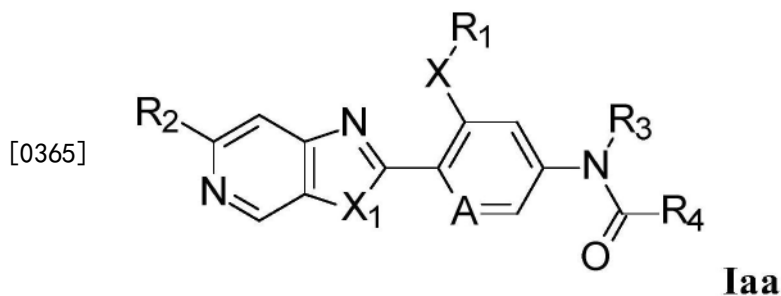
[0360] 可以通过使具有式I的化合物与适合的氧化剂(例如 $H_2O_2$ /尿素加合物)在酸酐(例如三氟乙酸酐)的存在下进行反应来制备N-氧化物。此类氧化从文献中,例如从J. Med. Chem. [药物化学杂志], 32(12), 2561-73, 1989或WO 2000/15615中是已知的。

[0361] 如果单个组分具有不同的生物活性,有利的是在每一情况下分离或合成生物学上更有效的异构体,例如对映异构体或非对映异构体或异构体混合物,例如对映异构体混合物或非对映异构体混合物。

[0362] 如果适当的话,具有式I的化合物和适当时其互变异构体(在每种情况下呈游离形式或呈盐形式)还能以水合物的形式获得和/或包括其他溶剂,例如可以用于使以固体形式存在的化合物结晶的那些。

[0363] 根据下表A-1至A-17和B-1至B-2的化合物可以根据以上描述的方法制备。以下实例旨在说明本发明并且示出优选的具有式I的化合物。

[0364] 下表A-1至A-17说明了本发明的具体化合物。



[0366] 表Y:R<sub>4</sub>的取代基定义:

索引	R <sub>4</sub>	索引	R <sub>4</sub>
1	CH <sub>3</sub>	12	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	13	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>
3	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	14	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>
4	Cyp	15	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
5	CH <sub>2</sub> Cl	16	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
6	CF <sub>3</sub>	17	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
7	CHF <sub>2</sub>	18	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OH
8	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	19	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
9	CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	20	CH <sub>2</sub> F
10	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	21	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CN
11	CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	22	

[0368] 在表Y和表A中,“Cyp”表示环丙基。

[0369] 表A-1提供了22种具有式Iaa的化合物A-1.001至A-1.022,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,R<sub>3</sub>是H,X是S,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是N并且R<sub>4</sub>是如表Y中所定义的。

[0370] 表A-2提供了22种具有式Iaa的化合物A-2.001至A-2.022,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,R<sub>3</sub>是H,X是SO<sub>2</sub>,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是N并且R<sub>4</sub>是如表Y中所定义的。

[0371] 表A-3提供了22种具有式Iaa的化合物A-3.001至A-3.022,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,R<sub>3</sub>是CH<sub>3</sub>,X是S,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是N并且R<sub>4</sub>是如表Y中所定义的。

[0372] 表A-4提供了22种具有式Iaa的化合物A-4.001至A-4.022,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,R<sub>3</sub>是CH<sub>3</sub>,X是SO<sub>2</sub>,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是N并且R<sub>4</sub>是如表Y中所定义的。

[0373] 表A-5提供了22种具有式Iaa的化合物A-5.001至A-5.022,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,R<sub>3</sub>是Cyp,X是SO<sub>2</sub>,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是N并且R<sub>4</sub>是如表Y中所定义的。

[0374] 表A-6提供了22种具有式Iaa的化合物A-6.001至A-6.022,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,R<sub>3</sub>是OCH<sub>3</sub>,X是SO<sub>2</sub>,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是N并且R<sub>4</sub>是如表Y中所定义的。

[0375] 表A-7提供了22种具有式Iaa的化合物A-7.001至A-7.022,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,R<sub>3</sub>是CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>,X是SO<sub>2</sub>,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是N并且R<sub>4</sub>是如表Y中所定义的。

[0376] 表A-8提供了22种具有式Iaa的化合物A-8.001至A-8.022,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,R<sub>3</sub>是CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>,X是SO<sub>2</sub>,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是N并且R<sub>4</sub>是如表Y中所定义的。

[0377] 表A-9提供了22种具有式Iaa的化合物A-9.001至A-9.022,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,R<sub>3</sub>是H,X是SO,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是N并且R<sub>4</sub>是如表Y中所定义的。

[0378] 表A-10提供了22种具有式Iaa的化合物A-10.001至A-10.022,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,R<sub>3</sub>是CH<sub>3</sub>,X是SO,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是N并且R<sub>4</sub>是如表Y中所定义的。

[0379] 表A-11提供了22种具有式Iaa的化合物A-11.001至A-11.022,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,R<sub>3</sub>是CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,X是S,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是N并且R<sub>4</sub>是如表Y中所定义的。

[0380] 表A-12提供了22种具有式Iaa的化合物A-12.001至A-12.022,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,R<sub>3</sub>是CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,X是SO<sub>2</sub>,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是N并且R<sub>4</sub>是如表Y中所定义的。

[0381] 表A-13提供了22种具有式Iaa的化合物A-13.001至A-13.022,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,R<sub>3</sub>是CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>,X是SO,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是N并且R<sub>4</sub>是如表Y中所定义的。

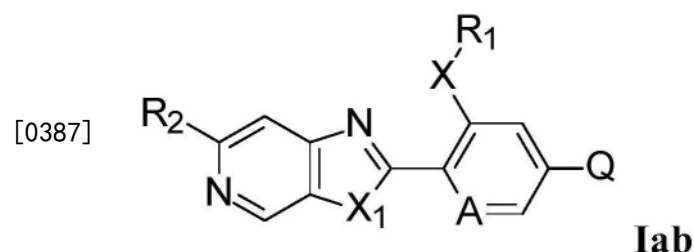
[0382] 表A-14提供了22种具有式Iaa的化合物A-14.001至A-14.022,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,R<sub>3</sub>是H,X是S,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是CH并且R<sub>4</sub>是如表Y中所定义的。

[0383] 表A-15提供了22种具有式Iaa的化合物A-15.001至A-15.022,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,R<sub>3</sub>是H,X是SO<sub>2</sub>,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是CH并且R<sub>4</sub>是如表Y中所定义的。

[0384] 表A-16提供了22种具有式Iaa的化合物A-16.001至A-16.022,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,R<sub>3</sub>是CH<sub>3</sub>,X是S,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是CH并且R<sub>4</sub>是如表Y中所定义的。

[0385] 表A-17提供了22种具有式Iaa的化合物A-17.001至A-17.022,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,R<sub>3</sub>是CH<sub>3</sub>,X是SO<sub>2</sub>,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是CH并且R<sub>4</sub>是如表Y中所定义的。

[0386] 以下表B-1至B-2说明了本发明的另外的具体化合物。



[0388] 表B-1提供了17种具有式Iab的化合物B-1.001至B-1.017,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,X是S,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是N并且Q是如表Z中所定义的。

[0389] 表B-2提供了17种具有式Iab的化合物B-2.001至B-2.017,其中R<sub>1</sub>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,R<sub>2</sub>是CF<sub>3</sub>,X是SO<sub>2</sub>,X<sub>1</sub>是NCH<sub>3</sub>,A是N并且Q是如表Z中所定义的。

[0390] 表Z:Q的取代基定义:

索引	Q	索引	Q	索引	Q	索引	Q
1		6		11		16	
2		7		12		17	
[0391]	3	8		13			
	4	9		14			
	5	10		15			

[0392] 根据本发明的具有式I的化合物在有害生物控制领域中是有预防和/或治疗价值的活性成分,即使是在低的施用量下,它们具有非常有利的杀生物谱并且是温血物种、鱼以及植物良好耐受的。根据本发明的这些活性成分作用于正常敏感的以及还有抗性的动物有害生物(如昆虫或蜱螨目的代表)的所有的或个别的发育阶段。根据本发明的活性成分的杀昆虫或杀螨活性可以本身直接显现出来,即立即或仅在过去一些时间之后(例如在蜕皮期间)发生对有害生物的破坏;或间接显现出来,例如降低产卵和/或孵化率,对应于至少50%至60%的破坏率(死亡率)的良好活性。

[0393] 以上提及的动物有害生物的实例是:

[0394] 来自蜱螨目,例如

[0395] 下毛瘿螨属物种(*Acalitus* spp.)、针刺瘿螨属物种(*Aculus* spp.)、窄瘿螨属物种(*Acaricalus* spp.)、瘤瘿螨属物种(*Aceria* spp.)、粗脚粉螨(*Acarus siro*)、钝眼蜱属物种(*Amblyomma* spp.)、锐缘蜱属物种(*Argas* spp.)、牛蜱属物种(*Boophilus* spp.)、短须螨属物种(*Brevipalpus* spp.)、苔螨属物种(*Bryobia* spp.)、上三脊瘿螨属物种(*Calipitrimerus* spp.)、皮螨属物种(*Chorioptes* spp.)、鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*)、表皮螨属物种(*Dermatophagoides* spp.)、始叶螨属物种(*Eotetranychus* spp.)、瘿螨属物种(*Eriophyes* spp.)、半跗线螨属物种(*Hemitarsonemus* spp.)、璃眼蜱属物种(*Hyalomma* spp.)、硬蜱属物种(*Ixodes* spp.)、小爪螨属物种(*Olygonychus* spp.)、钝缘蜱属物种(*Ornithodoros* spp.)、侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonema latus*)、全爪螨属物种(*Panonychus* spp.)、桔芸锈螨(*Phyllocoptruta oleivora*)、植食螨属物种(*Phytonemus* spp.)、多食跗线螨属物种(*Polyphagotarsonemus* spp.)、痒螨属物种(*Psoroptes* spp.)、扇头蜱属物种(*Rhipicephalus* spp.)、根螨属物种(*Rhizoglyphus* spp.)、疥螨属物种(*Sarcoptes* spp.)、狭跗线螨属物种(*Steneotarsonemus* spp.)、跗线螨属物种(*Tarsonemus*

spp.)以及叶螨属物种(*Tetranychus* spp.);

[0396] 来自虱目,例如

[0397] 血虱属物种(*Haematopinus* spp.)、长颚虱属物种(*Linognathus* spp.)、人虱属物种(*Pediculus* spp.)、瘦绵蚜属物种(*Pemphigus* spp.)以及根瘤蚜属物种(*Phylloxera* spp.);

[0398] 来自鞘翅目,例如

[0399] 叩甲属物种(*Agriotes* spp.)、欧洲鳃角金龟(*Amphimallon majale*)、东方异丽金龟(*Anomala orientalis*)、花象属物种(*Anthonomus* spp.)、蜉金龟属物种(*Aphodius* spp.)、玉米拟花萤(*Astylus atromaculatus*)、金龟属物种(*Ataenius* spp.)、甜菜隐食甲(*Atomaria linearis*)、甜菜胫跳甲(*Chaetocnema tibialis*)、萤叶甲属物种(*Cerotoma* spp.)、宽胸叩头虫属物种(*Conoderus* spp.)、根颈象属物种(*Cosmopolites* spp.)、绿花金龟(*Cotinis nitida*)、象虫属物种(*Curculio* spp.)、圆头犀金龟属物种(*Cyclocephala* spp.)、皮蠹属物种(*Dermestes* spp.)、根萤叶甲属物种(*Diabrotica* spp.)、阿根廷兜虫(*Diloboderus abderus*)、食植瓢虫属物种(*Epilachna* spp.)、*Eremnus*属物种、黑异爪蔗金龟(*Heteronychus arator*)、咖啡果小蠹(*Hypothenemus hampei*)、*Lagria vilosa*、马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata*)、稻水象属物种(*Lissorhoptrus* spp.)、*Liogenys*属物种、*Maecolaspis*属物种、栗色绒金龟(*Maladera castanea*)、美洲叶甲属物种(*Megascelis* spp.)、油菜花露尾甲(*Melighetes aeneus*)、鳃金龟属物种(*Melolontha* spp.)、*Myochrous armatus*、锯谷盗属物种(*Oryzaephilus* spp.)、耳喙象属物种(*Otiorhynchus* spp.)、鳃角金龟属物种(*Phyllophaga* spp.)、斑象属物种(*Phlyctinus* spp.)、弧丽金龟属物种(*Popillia* spp.)、蚤跳甲属物种(*Psylliodes* spp.)、*Rhyssomatus aubtilis*、劫根蠹属物种(*Rhizopertha* spp.)、金龟子科(*Scarabeidae*)、米象属物种(*Sitophilus* spp.)、麦蛾属物种(*Sitotroga* spp.)、伪切根虫属物种(*Somaticus* spp.)、尖隐喙象属物种、大豆茎象(*Sternechus subsignatus*)、拟步行虫属物种(*Tenebrio* spp.)、拟谷盗属物种(*Tribolium* spp.)以及斑皮蠹属物种(*Trogoderma* spp.);

[0400] 来自双翅目,例如

[0401] 伊蚊属物种(*Aedes* spp.)、疟蚊属物种(*Anopheles* spp.)、高粱芒蚊(*Antherigona soccata*)、橄榄果实蝇(*Bactrocea oleae*)、花园毛蚊(*Bibio hortulanus*)、迟眼蕈蚊属物种(*Bradysia* spp.)、红头丽蝇(*Calliphora erythrocephala*)、小条实蝇属物种(*Ceratitis* spp.)、金蝇属物种(*Chrysomyia* spp.)、库蚊属物种(*Culex* spp.)、黄蝇属物种(*Cuterebra* spp.)、寡鬃实蝇属物种(*Dacus* spp.)、地种蝇属物种(*Delia* spp.)、黑腹果蝇(*Drosophilamelanogaster*)、厕蝇属物种(*Fannia* spp.)、胃蝇属物种(*Gastrophilus* spp.)、*Geomyza tripunctata*、舌蝇属物种(*Glossina* spp.)、皮蝇属物种(*Hypoderma* spp.)、虱蝇属物种(*Hyppobosca* spp.)、斑潜蝇属物种(*Liriomyza* spp.)、绿蝇属物种(*Lucilia* spp.)、黑潜蝇属物种(*Melanagromyza* spp.)、家蝇属物种(*Musca* spp.)、狂蝇属物种(*Oestrus* spp.)、瘦蚊属物种(*Orseolia* spp.)、瑞典麦秆蝇(*Oscinella frit*)、藜藜蝇(*Pegomyia hyoscyami*)、草种蝇属物种(*Phorbia* spp.)、绕实蝇属物种(*Rhagoletis* spp.)、*Rivelia quadrifasciata*、*Scatella*属物种、尖眼蕈蚊属物种(*Sciara* spp.)、螫蝇属物种(*Stomoxys* spp.)、虻属物种(*Tabanus* spp.)、绦虫属物种(*Tannia* spp.)以及大蚊属

物种(Tipula spp.);

[0402] 来自半翅目,例如

[0403] 瘤缘蝽(*Acanthocoris scabrator*)、拟缘蝽属物种(*Acrosternum* spp)、苜蓿盲蝽(*Adelphocoris lineolatus*)、土黄缘蝽、海虾盾缘蝽(*Bathycoelia thalassina*)、土长蝽属物种、臭虫属物种、*Clavigralla tomentosicollis*、盲蝽属物种(*Creontiades* spp.)、可可瘤盲蝽、*Dichelops furcatus*、棉红蝽属物种、埃德萨属物种(*Edessa* spp)、美洲蝽属物种(*Euchistus* spp.)、六斑菜蝽(*Eurydema pulchrum*)、扁盾蝽属物种、茶翅蝽、具凹巨股长蝽(*Horcias nobilellus*)、稻缘蝽属物种、草盲蝽属物种、热带硕蚱属物种、卷心菜斑色蝽(*Murgantia histrionic*)、新长缘蝽属物种、烟盲蝽(*Nesidiocoris tenuis*)、绿蝽属物种、拟长蝽(*Nysius simulans*)、海岛蝽象、皮蝽属物种、壁蝽属物种、红猎蝽属物种、可可褐盲蝽、栗土蝽(*Scaptocoris castanea*)、黑蝽属物种(*Scotinophara* spp.)、*Thyanta*属物种、锥鼻虫属物种、木薯网蝽(*Vatiga illudens*);

[0404] 豌豆无网长管蚜(*Acyrtosium pisum*)、*Adalges*属物种、*Agalliana ensigera*、塔尔吉隆脉木虱、粉虱属物种(*Aleurodicus* spp.)、刺粉虱属物种(*Aleurocanthus* spp.)、甘蔗穴粉虱、软毛粉虱(*Aleurothrixus floccosus*)、甘蓝粉虱(*Aleyrodes brassicae*)、棉叶蝉(*Amarasca biguttula*)、檬果长突叶蝉、肾圆盾蚧属物种、蚜科、蚜属物种、圆盾蚧属物种(*Aspidiotus* spp.)、茄沟无网蚜、马铃薯/番茄木虱(*Bactericera cockerelli*)、小粉虱属物种、短尾蚜属物种(*Brachycaudus* spp.)、甘蓝蚜、喀木虱属物种、双尾蚜(*Cavariella aegopodii* Scop.)、蜡蚧属物种、黑褐圆盾蚧、橙褐圆盾蚧、大叶蝉属物种、大白叶蝉(*Cofana spectra*)、隐瘤蚜属物种、叶蝉属物种、褐软蚧、玉米黄翅叶蝉、裸粉虱属物种、柑橘木虱、麦双尾蚜、西圆尾蚜属物种、小绿叶蝉属物种、苹果绵蚜、葡萄斑叶蝉属物种、*Gascardia*属物种、赤桉木虱(*Glycaspis brimblecombei*)、菜缢管蚜(*Hyadaphis pseudobrassicae*)、大尾蚜属物种(*Hyalopterus* spp.)、超瘤蚜种(*Hyperomyzus pallidus*)、檬果绿叶蝉(*Idioscopus clypealis*)、非洲叶蝉、灰飞虱属物种、水土坚蚧、蛎盾蚧属物种、萝卜蚜(*Lopaphis erysimi*)、*Lyogenys maidis*、长管蚜属物种、沫蝉属物种、蛾蜡蝉科(*Metcalfa pruinosa*)、麦无网蚜、麦蜡蝉、瘤蚜属物种、新声蚜属物种(*Neotoxoptera* sp)、黑尾叶蝉属物种、褐飞虱属物种(*Nilaparvata* spp.)、梨大绿蚜、*Odonaspis ruthae*、甘蔗棉蚜、杨梅缘粉虱、考氏木虱、片盾蚧属物种、瘦绵蚜属物种、玉米蜡蝉、扁角飞虱属物种、忽布疣蚜、根瘤蚜属物种(*Phylloxera* spp)、动性球菌属物种、桑白盾蚧属物种、粉蚧属物种、棉跳盲蝽(*Pseudatomoscelis seriatus*)、木虱属物种、棉蚧(*Pulvinaria aethiopica*)、齿盾蚧属物种、*Quesada gigas*、电光叶蝉(*Recilia dorsalis*)、缢管蚜属物种、黑盔蚧属物种、带叶蝉属物种、二叉蚜属物种、麦蚜属物种(*Sitobion* spp.)、白背飞虱、三角苜蓿跳虫(*Spissistilus festinus*)、条斑飞虱(*Tarophagus Proserpina*)、声蚜属物种、粉虱属物种、*Tridiscus sporoboli*、葵粉蚧属物种(*Trionymus* spp.)、非洲木虱、矢尖蚧、火焰斑叶蝉、*Zyginidia scutellaris*;

[0405] 来自膜翅目,例如

[0406] 顶切叶蚁属(*Acromyrmex*)、三节叶蜂属物种(*Arge* spp.)、切叶蚁属物种(*Atta* spp.)、茎叶蜂属物种(*Cephus* spp.)、松叶蜂属物种(*Diprion* spp.)、锯角叶蜂科(*Diprionidae*)、松叶蜂(*Gilpinia polytoma*)、实叶蜂属物种(*Hoplocampa* spp.)、毛蚁属

物种 (*Lasius* spp.)、小黄家蚁 (*Monomorium pharaonis*)、新松叶蜂属物种 (*Neodiprion* spp.)、农蚁属物种 (*Pogonomyrmex* spp.)、红火蚁、水蚁属物种 (*Solenopsis* spp.) 以及胡蜂属物种 (*Vespa* spp.)；

[0407] 来自等翅目, 例如

[0408] 家白蚁属物种 (*Coptotermes* spp)、白蚁 (*Cornitermes cumulans*)、楹白蚁属物种 (*Incisitermes* spp)、大白蚁属物种 (*Macrotermes* spp)、澳白蚁属物种 (*Mastotermes* spp)、小白蚁属物种 (*Microtermes* spp)、散白蚁属物种 (*Reticulitermes* spp.)；热带火蚁 (*Solenopsis geminate*)

[0409] 来自鳞翅目 (*Lepidoptera*), 例如,

[0410] 长翅卷蛾属物种、褐带卷蛾属物种、透翅蛾属物种、地夜蛾属物种、棉叶虫、*Amylois* 属物种、黎豆夜蛾、黄卷蛾属物种、银蛾属物种 (*Argyresthia* spp.)、带卷蛾属物种、丫纹夜蛾属物种、棉潜蛾、玉米楷夜蛾、粉斑螟蛾、桃蛀果蛾、禾草螟属物种、色卷蛾属物种、越蔓桔草螟 (*Chrysoteuchia topiaria*)、葡萄果蠹蛾、卷叶螟属物种、云卷蛾属物种、纹卷蛾属物种、鞘蛾属物种、篱笆豆粉蝶 (*Colias lesbia*)、小造桥夜蛾 (*Cosmophila flava*)、草螟属物种、大菜螟、苹果异形小卷蛾、黄杨木蛾、小卷蛾属物种、黄杨绢野螟、杆草螟属物种、苏丹棉铃虫、钻夜蛾属物种、甘薯杆螟、粉斑螟属物种、叶小卷蛾属物种 (*Epinotia* spp.)、盐泽灯蛾 (*Estigmene acrea*)、*Etiella zinckinella*、花小卷蛾属物种、环针单纹卷蛾、黄毒蛾属物种、切根虫属物种、*Feltia jaculiferia*、小食心虫属物种 (*Grapholita* spp.)、云雾广翅小卷蛾、实夜蛾属物种、菜螟、切叶野螟属物种 (*Herpetogramma* spp.)、美国白蛾、番茄蠹蛾、*Lasmopalpus lignosellus*、旋纹潜叶蛾、潜叶细蛾属物种、葡萄花翅小卷蛾、*Loxostege bifidalis*、毒蛾属物种、潜蛾属物种、幕枯叶蛾属物种 (*Malacosoma* spp.)、甘蓝夜蛾、烟草天蛾、光腹夜蛾属物种 (*Mythimna* spp.)、夜蛾属物种、秋尺蛾属物种、*Orniodes indica*、欧洲玉米螟、超小卷蛾属物种、褐卷蛾属物种、小眼夜蛾、蛀茎夜蛾、红铃麦蛾、咖啡潜叶蛾、一星黏虫、马铃薯麦蛾、菜粉蝶、粉蝶属物种、小菜蛾、小白巢蛾属物种、尺叶蛾属物种、薄荷灰夜蛾 (*Rachiplusia nu*)、西方豆地香 (*Richia albicosta*)、白禾螟属物种 (*Scirpophaga* spp.)、蛀茎夜蛾属物种、长须卷蛾属物种、灰翅夜蛾属物种、棉大卷叶螟、兴透翅蛾属物种、异舟蛾属物种、卷蛾属物种、粉纹夜蛾、番茄斑潜蝇、以及巢蛾属物种；

[0411] 来自食毛目 (*Mallophaga*), 例如,

[0412] 畜虱属物种 (*Damalinea* spp.) 和啮毛虱属物种 (*Trichodectes* spp.)；

[0413] 来自直翅目 (*Orthoptera*), 例如,

[0414] 螻属物种 (*Blatta* spp.)、小螻属物种 (*Blattella* spp.)、蝼蛄属物种 (*Grylotalpa* spp.)、马德拉蜚螻 (*Leucophaea maderae*)、飞蝗属物种 (*Locusta* spp.)、北痣蟋蟀 (*Neocurtilla hexadactyla*)、大螻属物种 (*Periplaneta* spp.)、痣蟋蟀属物种 (*Scapteriscus* spp.)、以及沙漠蝗属物种 (*Schistocerca* spp.)；

[0415] 来自啮虫目 (*Psocoptera*), 例如,

[0416] 虱啮属物种 (*Liposcelis* spp.)；

[0417] 来自蚤目 (*Siphonaptera*), 例如,

[0418] 角叶蚤属物种 (*Ceratophyllus* spp.)、栉头蚤属物种 (*Ctenocephalides* spp.) 以



及开皇客蚤 (*Xenopsylla cheopis*);

[0419] 来自缨翅目 (*Thysanoptera*), 例如,

[0420] *Calliothrips phaseoli*、花蓟马属物种 (*Frankliniella* spp.)、阳蓟马属物种 (*Heliothrips* spp.)、褐带蓟马属物种 (*Hercinothrips* spp.)、单亲蓟马属物种 (*Parthenothrips* spp.)、非洲桔硬蓟马 (*Scirtothrips aurantii*)、大豆蓟马 (*Sericothrips variabilis*)、带蓟马属物种 (*Taeniothrips* spp.)、蓟马属物种 (*Thrips* spp.);

[0421] 来自缨尾目 (*Thysanura*), 例如, 衣鱼 (*Lepisma saccharina*)。

[0422] 根据本发明的活性成分可用于控制、即遏制或破坏上述类型的有害生物, 这些有害生物特别出现在植物上, 尤其是在农业中、在园艺中以及在林业中的有用的植物和观赏植物上, 或者在这些植物的器官上, 例如果实、花、叶、茎、块茎或根, 并且在一些情况下, 甚至在一个随后的时间点形成的植物器官仍保持受保护以抵抗这些有害生物。

[0423] 特别地, 适宜的目标作物是, 谷物, 如小麦、大麦、黑麦、燕麦、稻、玉米或高粱; 甜菜, 如糖用甜菜或饲料甜菜; 水果, 例如梨果、核果或无核小果, 如苹果、梨、李子、桃、杏、樱桃或浆果, 例如草莓、覆盆子或黑莓; 豆科作物, 如菜豆、小扁豆、豌豆或大豆; 油料作物, 如油菜、芥菜、罌粟、橄榄、向日葵、椰子、蓖麻、可可豆或落花生; 瓜类作物, 如南瓜、黄瓜或甜瓜; 纤维植物, 如棉花、亚麻、大麻或黄麻; 柑橘类水果, 如橙子、柠檬、葡萄柚或橘子; 蔬菜, 如菠菜、莴苣、芦笋、卷心菜、胡萝卜、洋葱、番茄、马铃薯或灯笼椒; 樟科, 如鳄梨、肉桂或樟脑; 以及还有烟草、坚果、咖啡、茄子、甘蔗、茶、胡椒、葡萄藤、蛇麻草、车前草科以及乳胶植物。

[0424] 本发明的组合物和/或方法还可以用在任何观赏植物和/或蔬菜作物 (包括花、灌木、阔叶树和常绿植物) 上。

[0425] 例如, 本发明可以用于任何以下观赏植物物种: 藿香蓟属物种、假面花属物种 (*Alonsoa* spp.)、银莲花属物种、南非葵 (*Anisodonteia capensis*)、春黄菊属物种、金鱼草属物种、紫菀属物种、秋海棠属物种 (例如丽格海棠、四季秋海棠、球根秋海棠 (*B. tubéreux*))、叶子花属物种、雁河菊属物种 (*Brachycome* spp.)、芸苔属物种 (观赏植物)、蒲包草属物种、辣椒、长春花、美人蕉属物种、矢车菊属物种、菊属物种、瓜叶菊属物种 (银叶菊 (*C. maritime*))、金鸡菊属物种、红景天 (*Crassula coccinea*)、火红萼距花 (*Cuphea ignea*)、大丽花属物种、翠雀属物种、荷包牡丹、彩虹菊属物种 (*Dorotheantus* spp.)、洋桔梗、连翘属物种、倒挂金钟属物种、老鹳草属鼠麴草属 (*Geranium gnaphalium*)、大丁草属物种、千日红、天芥菜属物种、向日葵属物种、木槿属物种、绣球花属物种、绣球属物种、嫣红蔓、凤仙花属物种 (非洲凤仙花)、血苋属物种 (*Iresines* spp.)、伽蓝菜属物种、马缨丹、三月花葵、狮耳花、百合属物种、松叶菊属物种、沟酸浆属物种、美国薄荷属物种、龙面花属物种、万寿菊属物种、石竹属物种 (康乃馨)、美人蕉属物种、酢浆草属物种、雏菊属物种、天竺葵属物种 (盾叶天竺葵、马蹄纹天竺葵)、堇菜属物种 (三色堇)、碧冬茄属物种、草夹竹桃属物种、香茶菜属物种 (*Plecthranthus* spp.)、一品红属物种、爬山虎属物种 (五叶爬山虎、爬山虎)、报春花属物种、毛茛属物种、杜鹃花属物种、蔷薇属物种 (玫瑰)、黄雏菊属物种、非洲堇属物种、鼠尾草属物种、紫扇花 (*Scaevola aemola*)、蛾蝶花 (*Schizanthus wisetonensis*)、景天属物种、茄属物种、苏非尼亚矮牵牛属物种 (*Surfinia* spp.)、万寿菊

属物种、烟草属物种、马鞭草属物种、百日草属物种以及其他花坛植物。

[0426] 例如,本发明可以用于任何以下蔬菜物种:葱属物种(大蒜、洋葱、*A. oschaninii*、韭葱、火葱、大葱)、茴香芹、旱芹(*Apium graveolus*)、芦笋、甜菜(*Beta vulgaris*)、芸苔属物种(甘蓝、大白菜、芜菁)、辣椒、鹰嘴豆、苦苣、菊苣属物种(菊苣、苦苣)、西瓜、黄瓜属物种(黄瓜、甜瓜)、南瓜属物种(西葫芦、印度南瓜)、菜蓟属物种(*Cyanara spp.*) (朝鲜蓟、刺苞菜蓟)、野胡萝卜、茴香、金丝桃属物种、莴苣、番茄属物种(番茄、圣女果番茄)、薄荷属物种、罗勒、香芹、菜豆属物种(菜豆、荷包豆)、豌豆、萝卜、食用大黄、迷迭香属物种、鼠尾草属物种、黑婆罗门参(*Scorzonera hispanica*)、茄子、菠菜、新缬草属物种(莴苣缬草、*V. eriocarpa*)以及蚕豆。

[0427] 优选的观赏植物物种包括非洲堇(*African violet*)、秋海棠属、大丽花属、大丁草属、绣球属、马鞭草属、蔷薇属、伽蓝菜属、一品红属、紫菀属、矢车菊属、金鸡菊属、翠雀属、美国薄荷属、草夹竹桃属、黄雏菊属、景天属、碧冬茄属、堇菜属、凤仙花属、老鹳草属、菊属、毛茛属、倒挂金钟属、鼠尾草属、绣球花属、迷迭香、鼠尾草、圣约翰草(*St. Johnswort*)、薄荷(*mint*)、甜椒(*sweet pepper*)、番茄和黄瓜(*cucumber*)。

[0428] 根据本发明的这些活性成分尤其适合于控制棉花、蔬菜、玉米、水稻以及大豆作物上的扁豆蚜、黄瓜条叶甲、烟芽夜蛾、桃蚜、小菜蛾以及海灰翅夜蛾。根据本发明的这些活性成分另外尤其适合于控制甘蓝夜蛾(优选地在蔬菜上)、苹果蠹蛾(优选地在苹果上)、小绿叶蝉(优选地在蔬菜、葡萄园里)、马铃薯叶甲(*Leptinotarsa*) (优选地在马铃薯上)以及二化螟(优选地在水稻上)。

[0429] 根据本发明的这些活性成分尤其适合于控制棉花、蔬菜、玉米、水稻以及大豆作物上的扁豆蚜、黄瓜条叶甲、烟芽夜蛾、桃蚜、小菜蛾以及海灰翅夜蛾。根据本发明的这些活性成分另外尤其适合于控制甘蓝夜蛾(优选地在蔬菜上)、苹果蠹蛾(优选地在苹果上)、小绿叶蝉(优选地在蔬菜、葡萄园里)、马铃薯叶甲(*Leptinotarsa*) (优选地在马铃薯上)以及二化螟(优选地在水稻上)。

[0430] 在另一方面中,本发明还可涉及一种控制由植物寄生线虫(内寄生的-、半内寄生的-和外寄生线虫)对植物及其部分的损害的方法,尤其是以下植物寄生线虫,如根结线虫(*root knot nematodes*)、北方根结线虫(*Meloidogyne hapla*)、南方根结线虫(*Meloidogyne incognita*)、爪哇根结线虫(*Meloidogyne javanica*)、花生根结线虫(*Meloidogyne arenaria*)以及其他根结线虫物种;孢囊形成线虫(*cyst-forming nematodes*)、马铃薯金线虫(*Globodera rostochiensis*)以及其他球孢囊线虫属(*Globodera*)物种;禾谷孢囊线虫(*Heterodera avenae*)、大豆孢囊线虫(*Heterodera glycines*)、甜菜孢囊线虫(*Heterodera schachtii*)、红三叶异皮线虫(*Heterodera trifolii*)、以及其他异皮线虫属(*Heterodera*)物种;种瘿线虫(*Seed gall nematodes*)、粒线虫属(*Anguina*)物种;茎及叶面线虫(*Stem and foliar nematodes*)、滑刃线虫属(*Aphelenchoides*)物种;刺毛线虫(*Sting nematodes*)、长尾刺线虫(*Belonolaimus longicaudatus*)以及其他刺线虫属(*Belonolaimus*)物种;松树线虫(*Pine nematodes*)、松材线虫(*Bursaphelenchus xylophilus*)以及其他伞滑刃属(*Bursaphelenchus*)物种;环形线虫(*Ring nematodes*)、环线虫属(*Criconema*)物种、小环线虫属(*Criconemella*)物种、轮线虫属(*Criconemoides*)物种、中环线虫属(*Mesocriconema*)物种;茎及鳞球茎线虫(*Stem*

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

[0431] 本发明的化合物还具有针对软体动物的活性。其实例包括例如福寿螺科;蛞蝓科(*Arion*) (黑蛞蝓(*A. ater*)、环状蛞蝓(*A. circumscriptus*)、棕阿勇蛞蝓(*A. hortensis*)、红蛞蝓(*A. rufus*));巴蜗牛科(*Bradybaenidae*) (灌木巴蜗牛(*Bradybaena fruticum*));葱蜗牛属(*Cepaea*) (花园葱蜗牛(*C. hortensis*)、森林葱蜗牛(*C. Nemoralis*));ochlodina;野蛞蝓属(*Deroceras*) (野灰蛞蝓(*D. agrestis*)、*D. empiricorum*、光滑野蛞蝓(*D. laeve*)、网纹野蛞蝓(*D. reticulatum*));圆盘螺属(*Discus*) (圆形圆盘蜗牛(*D. rotundatus*));*Euomphalia*;土蜗属(*Galba*) (截口土蜗(*G. trunculata*));小蜗牛属(*Helicelia*) (伊塔拉小蜗牛(*H. itala*)、布维小蜗牛(*H. obvia*));大蜗牛科(*Helicidae*) (*Helicigona arbustorum*);*Helicodiscus*;大蜗牛(*Helix*) (开口大蜗牛(*H. aperta*));蛞蝓属(*Limax*) (利迈科斯蛞蝓(*L. cinereoniger*)、黄蛞蝓(*L. flavus*)、边缘蛞蝓(*L. marginatus*)、大蛞蝓(*L. maximus*)、柔蛞蝓(*L. tenellus*));椎实螺属(*Lymnaea*);*Milax* (小蛞蝓科) (黑色小蛞蝓(*M. gagates*)、边缘小蛞蝓(*M. marginatus*)、硕氏小蛞蝓(*M. sowerbyi*));钻螺属(*Opeas*);瓶螺属(*Pomacea*) (福寿螺(*P. canaticulata*));瓦娄蜗牛属(*Vallonia*)和*Zanitoides*。

[0432] 术语“作物”应当理解为还包括已经通过使用重组DNA技术而被这样转化使其能够合成一种或多种选择性作用毒素的作物植物,这些毒素是如已知例如来自于产毒素细菌,尤其是芽孢杆菌属的那些细菌。

[0433] 可由此类转基因植物表达的毒素包括例如杀昆虫蛋白,例如来自蜡样芽孢杆菌或日本金龟子芽孢杆菌的杀昆虫蛋白;或者来自苏云金芽孢杆菌的杀昆虫蛋白,如 $\delta$ -内毒素,例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C,或者营养期杀昆虫蛋白(Vip),例如Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A;或细菌定植线虫的杀昆虫蛋白,例如光杆状菌属物种(*Photorhabdus* spp.)或致病杆菌属物种(*Xenorhabdus* spp.),诸如发光杆菌(*Photorhabdus luminescens*)、嗜线虫致病杆菌(*Xenorhabdus nematophilus*);由动物产生的毒素,诸如蝎毒素、蛛毒素、蜂毒素和其他昆虫特异性神经毒素;由真菌产生的毒素,如链霉菌毒素,植物凝集素类(lectin),如豌豆凝集素、大麦凝集素或雪花莲凝集素;凝集素(agglutinin);蛋白酶抑制剂,诸如胰蛋白酶抑制剂、丝蛋白酶抑制剂、马铃薯糖蛋白、胰抑素、木瓜蛋白酶抑制剂;核糖体失活蛋白(RIP),诸如蓖麻毒素、玉蜀黍-RIP、相思豆毒素、丝瓜籽毒蛋白、皂草毒素蛋白或异株泻根毒蛋白;类固醇代谢酶,如3-羟基类固醇氧化酶、蜕化类固醇-UDP-糖基-转移酶、胆固醇氧化酶、蜕化素抑制剂、HMG-COA-还原酶、离子通道阻断剂诸如钠通道或钙通道阻断剂、保幼激素酯酶、利尿激素受体、芪合酶、联苳合酶、几丁质酶和葡聚糖酶。

[0434] 在本发明的背景下, $\delta$ -内毒素(例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C)或营养期杀虫蛋白(Vip)(例如Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A)应理解为显然还包括混合型毒素、截短的毒素和经修饰的毒素。混合型毒素是通过那些蛋白的不同结构域的新组合重组产生的(参见例如,WO 02/15701)。截短的毒素,例如截短的Cry1Ab是已知的。在经修饰的毒素的情况下,天然存在的毒素的一个或多个氨基酸被置换。在这种氨基酸置换中,优选将非天然存在的蛋白酶识别序列插入毒素中,例如像在Cry3A055的情况下,一种组织蛋白酶-G-识别序列被插入Cry3A毒素中(参见WO 03/018810)。

[0435] 此类毒素或能够合成此类毒素的转基因植物的实例披露于例如EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451 878以及WO 03/052073中。

[0436] 用于制备这样的转基因植物的方法通常是本领域技术人员已知的并且描述在例如以上提及的公开物中。CryI型脱氧核糖核酸及其制备例如从WO 95/34656、EP-A-0 367 474、EP-A-0 401 979和WO 90/13651中已知。

[0437] 包括在转基因植物中的毒素使得植物对有害昆虫有耐受性。这样的昆虫可以存在于任何昆虫分类群,但尤其常见于甲虫(鞘翅目)、双翅昆虫(双翅目)和蛾(鳞翅目)。

[0438] 包含一种或多种编码杀昆虫剂抗性并且表达一种或多种毒素的基因的转基因植物是已知的并且其中一些是可商购的。此类植物的实例是:**YieldGard®**(玉米品种,表达Cry1Ab毒素);**YieldGard Rootworm®**(玉米品种,表达Cry3Bb1毒素);**YieldGard Plus®**(玉米品种,表达Cry1Ab和Cry3Bb1毒素);**Starlink®**(玉米品种,表达Cry9C毒素);**Herculex I®**(玉米品种,表达Cry1Fa2毒素和获得对除草剂草铵膦按盐耐药性的酶膦丝菌素N-乙酰基转移酶(PAT));**NuCOTN33B®**(棉花品种,表达Cry1Ac毒素);**Bollgard I®**(棉花品种,表达Cry1Ac毒素);**Bollgard II®**(棉花品种,表达Cry1Ac和Cry2Ab毒素);

**VipCot®** (棉花品种,表达Vip3A和Cry1Ab毒素); **NewLeaf®** (马铃薯品种,表达Cry3A毒素); **NatureGard®**、**Agrisure®** GT Advantage (GA21耐草甘膦性状)、**Agrisure®**CB Advantage (Bt11玉米螟(CB)性状) 以及 **Protecta®**。

[0439] 此类转基因作物的另外的实例是:

[0440] 1. Bt11玉米,来自先正达种子子公司(Syngenta Seeds SAS),霍比特路(Chemin de l'Hobit)27,F-31 790圣苏维尔(St.Sauveur),法国,登记号C/FR/96/05/10。遗传修饰的玉蜀黍,通过转基因表达截短的Cry1Ab毒素,使之能抵抗欧洲玉米螟(玉米螟和粉茎螟)的侵袭。Bt11玉米还转基因表达PAT酶以获得对除草剂草铵膦铵盐的耐受性。

[0441] 2. Bt176玉米,来自先正达种子子公司,霍比特路27,F-31 790圣苏维尔,法国,登记号C/FR/96/05/10。遗传修饰的玉蜀黍,通过转基因表达Cry1Ab毒素,使之能抵抗欧洲玉米螟(玉米螟和粉茎螟)的侵袭。Bt176玉米还转基因表达酶PAT以获得对除草剂草铵膦铵盐的耐受性。

[0442] 3. MIR604玉米,来自先正达种子子公司,霍比特路27,F-31 790圣苏维尔,法国,注册号C/FR/96/05/10。通过转基因表达经修饰的Cry3A毒素使之具有昆虫抗性的玉米。此毒素是通过插入组织蛋白酶-G-蛋白酶识别序列而经修饰的Cry3A055。此类转基因玉米植物的制备描述于WO 03/018810中。

[0443] 4. MON 863玉米,来自孟山都欧洲公司(Monsanto Europe S.A.),270-272特弗伦大道(Avenue de Tervuren),B-1150布鲁塞尔,比利时,登记号C/DE/02/9。MON 863表达Cry3Bb1毒素,并且对某些鞘翅目昆虫有抗性。

[0444] 5. IPC 531棉花,来自孟山都欧洲公司,270-272特弗伦大道,B-1150布鲁塞尔,比利时,登记号C/ES/96/02。

[0445] 6. 1507玉米,来自先锋海外公司(Pioneer Overseas Corporation),特德斯科大道(Avenue Tedesco),7B-1160布鲁塞尔,比利时,登记号C/NL/00/10。遗传修饰的玉米,表达蛋白质Cry1F以获得对某些鳞翅目昆虫的抗性,并且表达PAT蛋白质以获得对除草剂草丁膦铵的耐受性。

[0446] 7. NK603×MON 810玉米,来自孟山都欧洲公司270-272特弗伦大道,B-1150布鲁塞尔,比利时,登记号C/GB/02/M3/03。通过将遗传修饰的品种NK603和MON 810杂交,由常规育种的杂交玉米品种构成。NK603×MON 810玉米转基因地表达由土壤杆菌属菌株CP4获得的蛋白质CP4 EPSPS,使之耐除草剂**Roundup®**(含有草甘膦),以及还有由苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种获得的Cry1Ab毒素,使之耐某些鳞翅目昆虫,包括欧洲玉米螟。

[0447] 抗昆虫的植物的转基因作物还描述于BATS(生物安全与可持续发展中心(Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit),BATS中心(Zentrum BATS),克拉斯崔舍(Clarastrasse)13,巴塞尔(Basel)4058,瑞士)报告2003(<http://bats.ch>)中。

[0448] 术语“作物”应理解为还包括已经通过使用重组DNA技术而被这样转化使其能够合成具有选择性作用的抗病原物质的作物植物,这些抗病原物质是例如像所谓的“病程相关蛋白”(PRP,参见例如EP-A-0 392 225)。此类抗病原物质和能够合成此类抗病原物质的转基因植物的实例例如从EP-A-0 392 225、WO 95/33818和EP-A-0 353 191是已知的。生产此类转基因植物的方法对于本领域技术人员而言通常是已知的并且描述于例如以上提及的

公开物中。

[0449] 作物也可以经修饰以增加对真菌(例如镰孢霉属、炭疽病或疫霉属)、细菌(例如假单胞菌属)或病毒(例如马铃薯卷叶病毒、番茄斑萎病毒、黄瓜花叶病毒)病原体的抗性。

[0450] 作物还包括对线虫(如大豆异皮线虫)具有增加的抗性的那些作物。

[0451] 具有对非生物性胁迫的耐受性的作物包括例如通过NF-YB或本领域中已知的其他蛋白质的表达对于干旱、高盐、高温、寒冷、霜或光辐射具有增加的耐受性的那些作物。

[0452] 可由此类转基因植物表达的抗病原物质包括例如离子通道阻断剂,如钠通道和钙通道的阻断剂,例如病毒KP1、KP4或KP6毒素;芪合酶;联苳合酶;几丁质酶;葡聚糖酶;所谓“病程相关蛋白”(PRP;参见例如EP-A-0 392 225);由微生物产生的抗病原物质,例如肽抗生素或杂环抗生素(参见例如W0 95/33818)或参与植物病原体防御的蛋白质或多肽因子(所谓“植物疾病抗性基因”,如W0 03/000906中所述)。

[0453] 根据本发明的组合物的其他使用范围是保护所储存的物品和储存室以及保护原材料,如木材、纺织品、地板或建筑物,以及还在卫生领域中,尤其是保护人类、家畜以及多产的牲畜免遭所提及类型的有害生物的危害。

[0454] 本发明还提供了用于控制有害生物(如蚊和其他的疾病媒介物;同样参见[http://www.who.int/malaria/vector\\_control/irs/en/](http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/))的方法。在一个实施例中,用于控制有害生物的方法包括通过涂刷、轧制、喷雾、涂布或浸渍,向目标有害生物、它们的场所或表面或基底施用本发明的组合物。通过举例,通过本发明的方法考虑到了表面(如墙、天花板或地板表面)的IRS(室内滞留喷雾)施用。在另一个实施例中,考虑到了将此类组合物施用于如下基底,如无纺或织物材料,所述材料处于网织品、被覆物、被褥、窗帘以及帐篷的形式(或可以用于在这些物品的制造中使用)。

[0455] 在一个实施例中,用于控制此类有害生物的方法包括向目标有害生物、它们的场所或表面或基底施用杀有害生物有效量的本发明的组合物,以便于在所述表面或基底上提供有效的滞留的杀有害生物活性。这样的施用可以通过涂刷、轧制、喷雾、涂布或浸渍本发明的杀有害生物组合物来进行。通过举例,通过本发明的方法考虑到了表面(如墙、天花板或地板表面)的IRS施用,以便于在所述表面上提供有效的滞留的杀有害生物活性。在另一个实施例中,考虑了施用此类组合物以用于在基底上的有害生物的残留控制,所述基底是如处于网织品、被覆物、被褥、窗帘以及帐篷的形式(或可以用于在这些物品的制造中)的织物材料。

[0456] 有待处理的基底(包括无纺物、织物或网织品)可以由天然纤维,如棉花、拉菲亚树叶纤维、黄麻、亚麻、剑麻、粗麻布或羊毛,或者合成纤维,如聚酰胺、聚酯、聚丙烯、聚丙烯腈等等制成。聚酯是特别适合的。纺织品处理的方法是已知的,例如W0 2008/151984、W0 2003/034823、US 5631072、W0 2005/64072、W0 2006/128870、EP 1724392、W0 2005113886或W0 2007/090739。

[0457] 根据本发明的组合物的其他使用范围是针对所有观赏树木连同所有种类的果树和坚果树的树木注射/树干处理领域。

[0458] 在树木注射/树干处理领域中,根据本发明的化合物尤其适合于对抗来自如上提及的鳞翅目和来自鞘翅目的蛀木昆虫,尤其是对抗下表A和B中列出的蛀木虫:

[0459] 表A. 具有经济重要性的外来蛀木虫的实例。

科	种	受感染的宿主或作物
吉丁虫科	白蜡窄吉丁	白蜡木 (Ash)
天牛科	光肩天牛	硬木
[0460] 小蠹科	粗穗赖草足距小蠹 ( <i>Xylosandrus crassiusculus</i> )	硬木
	削尾材小蠹	硬木
	纵坑切梢小蠹	松柏类植物

[0461] 表B. 具有经济重要性的本地蛀木虫的实例。

科	种	受感染的宿主或作物
[0462] 吉丁虫科	桦铜窄吉丁 ( <i>Agrilus anxius</i> )	桦树
	磨光窄吉丁 ( <i>Agrilus politus</i> )	柳树、枫树
	<i>Agrilus sayi</i>	杨梅、香蕨木
	<i>Agrilus vittaticollis</i>	苹果树、梨树、蔓越橘、唐棣、山楂树
	革扁头吉丁 ( <i>Chrysobothris femorata</i> )	苹果、杏、山毛榉、白蜡槭、櫻桃树、栗树、红醋栗树、榆树、山楂树、朴树、山核桃树、欧洲七叶树、菩提树、枫树、欧洲花楸树、橡树、美洲山核桃树、梨树、桃树、柿子树、李子树、杨树、温柏、美国紫荆、唐棣、美国梧桐、核桃树、柳树
	<i>Texania campestris</i>	椴木、山毛榉、枫树、橡树、美国梧桐、柳树、黄杨
天牛科	对山毛榉天牛 ( <i>Goes pulverulentus</i> )	山毛榉、榆树、纳托尔 (Nuttall)、柳树、黑橡树、樱皮镰状栎、黑栎、美国梧桐
	虎橡天牛 ( <i>Goes tigrinus</i> )	橡树
	黑腹尼虎天牛 ( <i>Neoclytus acuminatus</i> )	白蜡木、山核桃树、橡树、核桃树、桦树、山毛榉、枫树、美洲铁木 (Eastern hophornbeam)、山茱萸、柿子树、美国紫荆、冬

[0463]

科	种	受侵染的宿主或作物
		青、朴树、洋槐、美国皂荚木 (Honeylocust)、黄杨、栗树、奥塞奇橙木 (Osage-orange)、黄樟、紫丁香、短叶紫杉 (Mountain-mahogany)、梨树、樱桃树、李子树、桃树、苹果树、榆树、菩提树、枫香
	三线无花果天牛 ( <i>Neoptychodes trilineatus</i> )	无花果树、赤杨木、桑树、柳树、网叶朴树 (Netleaf hackberry)
	灰翅筒天牛 ( <i>Oberea ocellata</i> )	漆树、苹果树、桃树、李子树、梨树、红醋栗树、黑莓
	三点筒天牛 ( <i>Oberea tripunctata</i> )	山茱萸、荚蒾属、榆树、酸模树、蓝莓、杜鹃花属、杜鹃、月桂树、杨树、柳树、桑树
	绕枝沟胫天牛 ( <i>Oncideres cingulata</i> )	山核桃树、美洲山核桃树、柿子树、榆树、酸模树、菩提树、美国皂荚木、山茱萸、桉树、橡树、朴树、枫树、果树
	对杨黄斑楔天牛 ( <i>Saperda calcarata</i> )	杨树
	<i>Strophiona nitens</i>	栗树、橡树、山核桃树、核桃树、山毛榉、枫树
小蠹科	<i>Corthylus columbianus</i>	枫树、橡树、黄杨、山毛榉、白蜡槭、美国梧桐、桦树、菩提树、栗树、榆树
	南方松大小蠹 ( <i>Dendroctonus frontalis</i> )	松树
	美桦毛小蠹 ( <i>Dryocoetes betulae</i> )	桦树、枫香、野樱桃树、山毛榉、梨树
	黄带芳小蠹 ( <i>Monarthrum fasciatum</i> )	橡树、枫树、桦树、栗树、枫香、蓝果木、杨树、山核桃树、含羞草、苹果树、桃树、松树
	桃鳃角小蠹 ( <i>Phloeotribus liminaris</i> )	桃树、樱桃树、李子树、黑樱桃树、榆树、桑树、欧洲花楸树



科	种	受感染的宿主或作物
	<i>Pseudopityophthorus pruinosus</i>	橡树、美国山毛榉木、黑樱桃树、契卡索李子树 (Chickasaw plum)、栗树、枫树、山核桃树、角树、铁木
[0464] 透翅蛾科	栋透翅蛾 ( <i>Paranthrene simulans</i> )	橡树、美洲栗树
	<i>Sannina uroceriformis</i>	柿子树
	小桃翅蛾	桃树、李子树、油桃树、樱桃树、杏树、扁桃树、黑樱桃树
	李桃翅蛾 ( <i>Synanthedon pictipes</i> )	桃树、李子树、樱桃树、山毛榉、黑樱桃树
	<i>Synanthedon rubrofascia</i>	蓝果树
	<i>Synanthedon scitula</i>	山茱萸、美洲山核桃、山核桃树、橡树、栗树、山毛榉、桦树、黑樱桃树、榆树、欧洲花椒树、荚蒾属、柳树、苹果树、枇杷树、九层皮、杨梅
	葡萄根透翅蛾 ( <i>Vitacea polistiformis</i> )	葡萄树

[0465] 本发明还可以用于控制任何可以存在于草坪草中的昆虫有害生物包括例如甲虫、毛虫、火蚁、地面珍珠 (ground pearl)、千足虫、潮虫、螨虫、蜈蚣、介壳虫、粉蚧、蜉蝣、沫蝉、南方麦小蠹以及蛴螬。本发明可以用于控制处于其生命周期的各个阶段的昆虫有害生物,包括卵、幼虫、若虫和成虫。

[0466] 具体而言,本发明可用于控制用草坪草的根部喂养的昆虫有害生物,所述昆虫有害生物包括蛴螬 (诸如圆头犀金龟属物种 (*Cyclocephala* spp.) (例如标记的金龟子、*C. lurida*)、*Rhizotrogus* 属物种 (例如欧洲金龟子,欧洲切根鳃金龟 (*R. majalis*))、黄栌属物种 (*Cotinus* spp.) (例如绿六月甲虫 (Green June beetle)、绿六月花金龟 (*C. nitida*))、弧丽金龟属物种 (*Popillia* spp.) (例如日本甲虫、日本弧丽金龟 (*P. japonica*))、鳃角金龟属物种 (*Phyllophaga* spp.) (例如五月/六月甲虫)、金龟属物种 (例如草坪草黑金龟 (*Black turfgrass ataenius*)、黑绒金龟)、绒毛金龟属物种 (*Maladera* spp.) (例如亚洲花园甲虫 (Asiatic garden beetle)、栗色绒金龟) 以及 *Tomarus* 属物种)、地面珍珠 (硕蚧属物种 (*Margarodes* spp.))、蜈蚣 (褐黄色的、南方的、以及短翅的; 痣蟋蟀属物种 (*Scapteriscus* spp.))、非洲蜈蚣 (*Grylotalpa africana*) 以及大蚊幼虫 (leather jackets) (欧洲大蚊 (*European crane fly*)、大蚊属物种 (*Tipula* spp.))。

[0467] 本发明还可以用于控制茅草住宅的草坪草的昆虫有害生物,这些昆虫有害生物包括粘虫 (诸如秋夜蛾 (fall armyworm) 草地贪夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*), 和常见粘虫一星黏虫 (*Pseudaletia unipuncta*))、切根虫,象鼻虫 (尖隐喙象属物种 (*Sphenophorus* spp.)), 诸如 *S. venatus verstitus* 和牧草长喙象 (*S. parvulus*) 以及草地螟 (如草地螟属物种

(*Crambus* spp.)和热带草地螟,*Herpetogramma phaeopteralis*)。

[0468] 本发明还可以用于控制在地上生活并取食草坪草叶子的草坪草中的昆虫有害生物,这些昆虫有害生物包括麦小蝽(诸如南方麦小蝽,南方杆长蝽(*Blissus insularis*))、狗牙根螨(*Bermudagrass mite*) (*Eriophyes cynodoniensis*)、盖氏虎尾草粉蚧(草竹粉蚧(*Antonina graminis*))、两线沫蝉(*Propsapia bicincta*)、叶蝉、切根虫(夜蛾科)、以及麦二叉蚜。

[0469] 本发明还可以用于控制草坪草中的其他有害生物,诸如在草坪中创建蚁巢的外引红火蚁(红火蚁(*Solenopsis invicta*))。

[0470] 在卫生领域中,根据本发明的组合物有效地对抗外寄生虫如硬蜱、软蜱、疥螨、秋螨、蝇(叮咬和舔舐)、寄生性蝇幼虫,虱、发虱、鸟虱和跳蚤。

[0471] 此类寄生虫的实例是:

[0472] 虱目:血虱属物种、长颚虱属物种(*Linognathus* spp.)、人虱属物种以及阴虱属物种(*Phtirus* spp.)、管虱属物种。

[0473] 食毛目:毛羽虱属物种、短羽虱属物种、鸭虱属物种、牛羽虱属物种、*Werneckiella* 属物种、*Lepikentron*属物种、畜虱属物种、啮毛虱属物种以及猫羽虱属物种(*Felicola* spp.)。

[0474] 双翅目及长角亚目(*Nematocera*)和短角亚目(*Brachycera*),例如伊蚊属物种(*Aedes* spp.)、疟蚊属物种、库蚊属物种(*Culex* spp.)、蚋属物种(*Simulium* spp.)、真蚋属物种(*Eusimulium* spp.)、白蛉属物种(*Phlebotomus* spp.)、罗蛉属物种(*Lutzomyia* spp.)、库蠓属物种(*Culicoides* spp.)、斑虻属物种(*Chrysops* spp.)、驼背虻属物种(*Hybomitra* spp.)、黄虻属物种(*Atylotus* spp.)、虻属物种(*Tabanus* spp.)、麻虻属物种(*Haematopota* spp.)、*Philipomyia*属物种、蜂虱蝇属物种(*Braula* spp.)、家蝇属物种(*Musca* spp.)、齿股蝇属物种(*Hydrotaea* spp.)、螫蝇属物种、黑角蝇属物种(*Haematobia* spp.)、莫蝇属物种(*Morellia* spp.)、厕蝇属物种(*Fannia* spp.)、舌蝇属物种(*Glossina* spp.)、丽蝇属物种(*Calliphora* spp.)、绿蝇属物种(*Lucilia* spp.)、金蝇属物种(*Chrysomyia* spp.)、污蝇属物种(*Wohlfahrtia* spp.)、麻蝇属物种(*Sarcophaga* spp.)、狂蝇属物种(*Oestrus* spp.)、皮蝇属物种(*Hypoderma* spp.)、胃蝇属物种(*Gasterophilus* spp.)、虱蝇属物种(*Hippobosca* spp.)、羊虱蝇属物种(*Lipoptena* spp.)和蜉蝇属物种(*Melophagus* spp.)。

[0475] 蚤目(*Siphonapterida*),例如蚤属物种(*Pulex* spp.)、栉头蚤属物种、客蚤属物种(*Xenopsylla* spp.)、角叶蚤属物种。

[0476] 异翅目(*Heteroptera*),例如臭虫属物种、锥鼻虫属物种、红猎蝽属物种、锥蝽属物种(*Panstrongylus* spp.)。

[0477] 蜚蠊目(*Blattaria*),例如东方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、美洲大蠊(*Periplaneta americana*)、德国小蠊(*Blattella germanica*)以及夏柏拉蟑螂属物种(*Supella* spp.)。

[0478] 蜱螨(*Acaria*)亚纲(螨科(*Acarida*))和后气门目(*Meta-stigmata*)和中气门目(*Meso-stigmata*),例如锐缘蜱属物种(*Argas* spp.)、钝缘蜱属物种(*Ornithodoros* spp.)、耳蜱属物种(*Otobius* spp.)、硬蜱属物种(*Ixodes* spp.)、钝眼蜱属物种(*Amblyomma*

spp.)、牛蜱属物种(*Boophilus* spp.)、革蜱属物种(*Dermacentor* spp.)、血蜱属物种(*Haemophysalis* spp.)、璃眼蜱属物种(*Hyalomma* spp.)、扇头蜱属物种(*Rhipicephalus* spp.)、皮刺螨属物种(*Dermanyssus* spp.)、刺利螨属物种(*Raillietia* spp.)、肺刺螨属物种(*Pneumonyssus* spp.)、胸刺螨属物种(*Sternostoma* spp.)和瓦螨属物种(*Varroa* spp.)。

[0479] 轴螨目(*Actinedida*) (前气门亚目(*Prostigmata*))和粉螨目(*Acaridida*) (无气门亚目(*Astigmata*)),例如蜂盾螨属物种(*Acarapis* spp.)、姬螯螨属物种(*Cheyletiella* spp.)、禽螯螨属物种(*Ornithocheyletia* spp.)、肉螨属物种(*Myobia* spp.)、疮螨属物种(*Psorergates* spp.)、蠕形螨属物种(*Demodex* spp.)、恙螨属物种(*Trombicula* spp.)、牦螨属物种(*Listrophorus* spp.)、粉螨属物种(*Acarus* spp.)、食酪螨属物种(*Tyrophagus* spp.)、嗜木螨属物种(*Caloglyphus* spp.)、颈下螨属物种(*Hypodectes* spp.)、翅螨属物种(*Pterolichus* spp.)、痒螨属物种(*Psoroptes* spp.)、皮螨属物种(*Chorioptes* spp.)、耳痒螨属物种(*Otodectes* spp.)、疥螨属物种(*Sarcoptes* spp.)、耳螨属物种(*Notoedres* spp.)、鸟疥螨属物种(*Knemidocoptes* spp.)、胞螨属物种(*Cytodites* spp.)以及鸡雏螨属物种(*Laminosioptes* spp.)。

[0480] 根据本发明的组合物还适用于保护在如木材、纺织品、塑料、粘合剂、胶、漆料、纸张和卡片、皮革、地板和建筑等情况下的材料免受昆虫侵染。

[0481] 根据本发明的组合物可以用于例如对抗以下有害生物:甲虫,如北美家天牛、长毛天牛、家具窃蠹、红毛窃蠹、梳角细脉窃蠹、*Dendrobium pertinex*、松芽枝窃蠹、*Priobium carpini*、褐粉蠹、非洲粉蠹、南方粉蠹、栎粉蠹、柔毛粉蠹、胸粉蠹、鳞毛粉蠹、材小蠹属物种、条木小蠹属物种、咖啡黑长蠹、榭长蠹、棕异翅长蠹、双棘长蠹属物种与竹长蠹;以及还有膜翅类,如蓝黑树蜂、大树蜂、泰加大树蜂与*Urocerus augur*;以及白蚁类,如欧洲木白蚁(*Kaloterme flavicollis*)、麻头堆砂白蚁、印巴结构木异白蚁、黄胸散白蚁、桑特散白蚁、欧洲散白蚁、达尔文澳白蚁、内华达古白蚁与家白蚁;以及蛀虫,如衣鱼。

[0482] 根据本发明的化合物可以按未经修饰的形式用作杀有害生物剂,但它们通常以多种方式使用配制辅助剂(如载体、溶剂以及表面活性物质)被配制成组合物。这些配制品可以处于不同的实体形式,例如,处于以下形式:撒粉剂、凝胶、可湿性粉剂、水可分散性颗粒剂、水可分散性片剂、泡腾压缩片剂、可乳化的浓缩物、微可乳化浓缩物、水包油乳剂、可流动油、水性分散体、油性分散体、悬乳剂、胶囊悬浮液、可乳化的颗粒剂、可溶性液体、水可溶性浓缩物(以水或水混溶性有机溶剂作为载体)、浸渍的聚合物膜或处于已知的其他形式,例如从Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides[关于杀有害生物剂的FAO和WHO标准的发展和使用的画册],联合国,第1版,二次修订(2010)中已知的。此类配制品可以直接使用或者可以使用前稀释再使用。可以用例如水、液体肥料、微量营养素、生物有机体、油或溶剂来进行稀释。

[0483] 可以通过例如将活性成分与配制辅助剂混合来制备这些配制品以便获得处于精细分散固体、颗粒、溶液、分散体或乳剂形式的组合物。这些活性成分还可以与其他辅助剂(例如精细分散固体、矿物油、植物或动物来源的油、改性的植物或动物来源的油、有机溶剂、水、表面活性物质或其组合)来一起配制。

[0484] 这些活性成分还可以被包含于非常精细的微胶囊中。微胶囊在多孔载体中含有活

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

[0485] 适合于制备根据本发明的组合物的配制辅助剂本身是已知的。作为液体载体可以使用:水、甲苯、二甲苯、石油醚、植物油、丙酮、甲基乙基酮、环己酮、酸酐、乙腈、乙酰苯、乙酸戊酯、2-丁酮、碳酸丁烯酯、氯苯、环己烷、环己醇、乙酸烷基酯、二丙酮醇、1,2-二氯丙烷、二乙醇胺、对-二乙基苯、二甘醇、松脂酸二乙二醇酯、二甘醇丁基醚、二甘醇乙基醚、二甘醇甲醚、N,N-二甲基甲酰胺、二甲基亚砷、1,4-二噁烷、二丙二醇、二丙二醇甲基醚、双丙甘醇二苯甲酸酯、二丙二醇、烷基吡咯烷酮、乙酸乙酯、2-乙基己醇、碳酸乙烯酯、1,1,1-三氯乙烷、2-庚酮、 $\alpha$ -蒎烯、d-蒎烯、乳酸乙酯、乙二醇、乙二醇丁基醚、乙二醇甲基醚、 $\gamma$ -丁内酯、丙三醇、乙酸甘油酯、二乙酸甘油酯、三乙酸甘油酯、十六烷、己二醇、乙酸异戊基酯、乙酸异冰片基酯、异辛烷、异佛尔酮、异丙苯、肉豆蔻酸异丙酯、乳酸、月桂胺、异亚丙基丙酮、甲氧基丙醇、甲基异戊基酮、甲基异丁基酮、月桂酸甲酯、辛酸甲酯、油酸甲酯、二氯甲烷、间二甲苯、正己烷、正辛胺、十八烷酸、辛酸乙酸酯、油酸、油烯基胺、邻二甲苯、苯酚、聚乙二醇、丙酸、乳酸丙酯、碳酸亚丙酯、丙二醇、丙二醇甲基醚、对-二甲苯、甲苯、磷酸三乙酯、三乙二醇、二甲苯磺酸、石蜡、矿物油、三氯乙烯、全氯乙烯、乙酸乙酯、乙酸戊酯、乙酸丁酯、丙二醇甲基醚、二乙二醇甲基醚、甲醇、乙醇、异丙醇以及更高分子量的醇,例如戊醇、四氢呋喃醇、己醇、辛醇、乙二醇、丙二醇、甘油、N-甲基-2-吡咯烷酮等。

[0486] 适合的固体载体是例如滑石、二氧化钛、叶蜡石黏土、硅石、凹凸棒石黏土、硅藻土、石灰石、碳酸钙、膨润土、钙蒙脱土、棉籽壳、小麦粉、大豆粉、浮石、木粉、经研磨的胡桃壳、木质素和类似的物质。

[0487] 许多表面活性物质可以有利地用在固体和液体配制品两者中,尤其是在使用前可被载体稀释的那些配制品中。表面活性物质可以是阴离子的、阳离子的、非离子的或聚合的并且它们可以用作乳化剂、湿润剂或悬浮剂或用于其他目的。典型的表面活性物质包括例如烷基硫酸酯的盐,如十二烷基硫酸二乙醇铵;烷基芳基磺酸酯的盐,如十二烷基苯磺酸钙;烷基酚/氧化烯加成产物,如乙氧基化壬基苯酚;醇/氧化烯加成产物,如乙氧基化十三烷醇;皂,如硬脂酸钠;烷基萘磺酸酯的盐,如二丁基萘磺酸钠;磺基琥珀酸二烷基酯的盐,如二(2-乙基己基)磺基琥珀酸钠;山梨糖醇酯,如山梨糖醇油酸酯;季铵,如氯化十二烷基三甲基铵;脂肪酸的聚乙二醇酯,如聚乙二醇硬脂酸酯;环氧乙烷和环氧丙烷的嵌段共聚物;以及磷酸单烷基酯和二烷基酯的盐;以及还有其他物质,例如描述于:McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual[麦卡琴清洁剂和乳化剂年鉴],MC出版公司(MC Publishing Corp.),里奇伍德,新泽西州(Ridgewood New Jersey)(1981)。

[0488] 可以用于杀有害生物配制品的另外的辅助剂包括结晶抑制剂、粘度改性剂、悬浮剂、染料、抗氧化剂、发泡剂、光吸收剂、混合助剂、消泡剂、络合剂、中和或改变pH的物质和

缓冲液、腐蚀抑制剂、香料、湿润剂、吸收增强剂、微量营养素、增塑剂、助流剂、润滑剂、分散剂、增稠剂、防冻剂、杀微生物剂、以及液体和固体肥料。

[0489] 根据本发明的组合物可以包括添加剂,所述添加剂包括植物或动物来源的油、矿物油、此类油的烷基酯或此类油与油衍生物的混合物。在根据本发明的组合物中的油添加剂的量通常是基于所述待施用的混合物的从0.01%到10%。例如,可以在喷雾混合物已经制备之后将所述油添加剂以所希望的浓度添加到喷雾罐中。优选的油添加剂包括矿物油或植物来源的油,例如菜籽油、橄榄油或葵花籽油;乳化的植物油;植物来源的油的烷基酯,例如甲基衍生物;或动物来源的油,如鱼油或牛脂。优选的油添加剂包括C<sub>8</sub>-C<sub>22</sub>脂肪酸的烷基酯,尤其是C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>脂肪酸的甲基衍生物,例如月桂酸、棕榈酸以及油酸的甲基酯(分别为月桂酸甲酯、棕榈酸甲酯和油酸甲酯)。许多油衍生物获知于Compendium of Herbicide Adjuvants [除草剂辅助剂纲要],第10版,南伊利诺伊大学,2010。

[0490] 这些本发明组合物总体上包括按重量计从0.1%至99%,尤其是按重量计从0.1%至95%的本发明的化合物以及按重量计从1%至99.9%的配制辅助剂,所述配制辅助剂优选地包括按重量计从0至25%的表面活性物质。而商用产品可以优选地被配制为浓缩物,最终使用者将通常使用稀释制品。

[0491] 施用比率在宽范围之内变化并且取决于土壤的性质、施用方法、作物植物、待控制的有害生物、主要气候条件、以及受施用方法、施用时间以及目标作物支配的其他因素。一般来讲,可以将化合物以从11/ha至20001/ha、尤其是从101/ha到10001/ha的比率施用。

[0492] 优选的配制品可以具有以下组成(重量%):

[0493] 可乳化的浓缩物:

[0494] 活性成分:1%至95%,优选60%至90%

[0495] 表面活性剂:1%至30%,优选5%至20%

[0496] 液体载体:1%至80%,优选1%至35%

[0497] 尘剂:

[0498] 活性成分:0.1%至10%,优选0.1%至5%

[0499] 固体载体:99.9%至90%,优选99.9%至99%

[0500] 悬浮液浓缩物:

[0501] 活性成分:5%至75%,优选10%至50%

[0502] 水:94%至24%,优选88%至30%

[0503] 表面活性剂:1%至40%,优选2%至30%

[0504] 可湿性粉剂:

[0505] 活性成分:0.5%至90%,优选1%至80%

[0506] 表面活性剂:0.5%至20%,优选1%至15%

[0507] 固体载体:5%至95%,优选15%至90%

[0508] 颗粒剂:

[0509] 活性成分:0.1%至30%,优选0.1%至15%

[0510] 固体载体:99.5%至70%,优选97%至85%

[0511] 以下实例进一步展示了(但不限制)本发明。

[0512] 

可湿性粉剂	a)	b)	c)
-------	----	----	----

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

[0513] 将所述组合与这些辅助剂充分混合并且将混合物在适当的研磨机中充分研磨,从而获得了可以用水稀释而给出所希望的浓度的悬浮液的可湿性粉剂。

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

[0515] 将所述组合与辅助剂充分混合并且将所述混合物在适合的研磨机中充分研磨,从而获得可以直接用于种子处理的粉剂。

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

[0517] 在植物保护中可以使用的具有任何所要求的稀释的乳液可以通过用水稀释从这种浓缩物中获得。

<b>尘剂</b>	<b>a)</b>	<b>b)</b>	<b>c)</b>
<b>活性成分</b>	<b>5%</b>	<b>6%</b>	<b>4%</b>
<b>滑石</b>	<b>95%</b>	-	-
<b>高岭土</b>	-	<b>94%</b>	-
<b>矿物填料</b>	-	-	<b>96%</b>

[0518] 通过将所述组合与载体混合并且将混合物在适当的研磨机中研磨而获得即用型尘剂。此类粉剂还可以用于种子的干拌种。

挤出机颗粒	
活性成分	15%
木质素磺酸钠	2%

羧甲基纤维素	1%
高岭土	82%

[0520] 将所述组合与这些辅助剂混合并且研磨,并且将混合物用水湿润。

[0521] 将混合物挤出并且然后在空气流中干燥。

[0522]

<u>包衣颗粒剂</u>	
活性成分	8%
聚乙二醇(分子量200)	3%
高岭土	89%

[0523] 将这种精细研磨的组合在混合器中均匀地施用于用聚乙二醇湿润的高岭土中。以此方式获得无尘的包衣的颗粒剂。

[0524] 悬浮液浓缩物

[0525]

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

[0526] 将精细地研磨的组合与辅助剂紧密地混合,得到悬浮液浓缩物,从所述悬浮液浓缩液可以通过用水稀释获得任何所希望的稀释度的悬浮液。使用此类稀释物,可以对活的植物连同植物繁殖材料进行处理并且对其针对微生物侵染通过喷雾、浇灌或浸渍进行保护。

[0527] 种子处理用的可流动性浓缩物

[0528]

活性成分	40%
丙二醇	5%
共聚物丁醇PO/E0	2%
三苯乙烯酚,具有10-20摩尔E0	2%
1,2-苯并异噻唑啉-3-酮(处于在水中20%的溶液形式)	0.5%
单偶氮-颜料钙盐	5%
硅酮油(处于在水中75%的乳液的形式)	0.2%
水	45.3%

[0529] 将精细地研磨的组合与辅助剂紧密地混合,得到悬浮液浓缩物,从所述悬浮液浓缩液可以通过用水稀释获得任何所希望的稀释度的悬浮液。使用此类稀释物,可以对活的植物连同植物繁殖材料进行处理并且对其针对微生物侵染通过喷雾、浇灌或浸渍进行保护。

[0530] 缓释的胶囊悬浮液

[0531] 将28份的组合与2份的芳香族溶剂以及7份的甲苯二异氰酸酯/多亚甲基-聚苯基异氰酸酯-混合物(8:1)进行混合。将此混合物在1.2份的聚乙烯醇、0.05份的消泡剂以及

51.6份的水的混合物中进行乳化直至达到所希望的粒度。向此乳液中添加在5.3份的水中的2.8份的1,6-己二胺混合物。将混合物搅拌直至聚合反应完成。将获得的胶囊悬浮液通过添加0.25份的增稠剂以及3份的分散剂进行稳定。所述胶囊悬浮液配制品包含28%的活性成分。介质胶囊的直径是8-15微米。将所得配制品作为适用于此目的装置中的水性悬浮液施用到种子上。

[0532] 配制品类型包括乳液浓缩物 (EC)、悬浮液浓缩物 (SC)、悬乳液 (SE)、胶囊悬浮液 (CS)、水可分散性颗粒剂 (WG)、可乳化的颗粒剂 (EG)、乳剂、油包水型乳液 (EO)、水包油型乳液 (EW)、微乳液 (ME)、油分散体 (OD)、油悬剂 (OF)、油溶性液剂 (OL)、可溶性浓缩物 (SL)、超低容量悬浮液 (SU)、超低容量液剂 (UL)、母药 (TK)、可分散性浓缩物 (DC)、可湿性粉剂 (WP)、可溶性颗粒剂 (SG) 或与农业上可接受的辅助剂组合的任何技术上可行的配制品。

[0533] 制备实例:

[0534] “Mp”是指以°C计的熔点。自由基表示甲基。<sup>1</sup>H NMR测量值在Bruker 400MHz光谱仪上记录,化学位移相对于TMS标准品以ppm给出。光谱在如指定的氘代溶剂中测量。用以下LCMS方法中的任一种来表征这些化合物。对于每种化合物获得的特征性LCMS值是保留时间 (“Rt”,以分钟记录)和测得的分子离子 (M+H)<sup>+</sup>。

[0535] LCMS和GCMS方法:

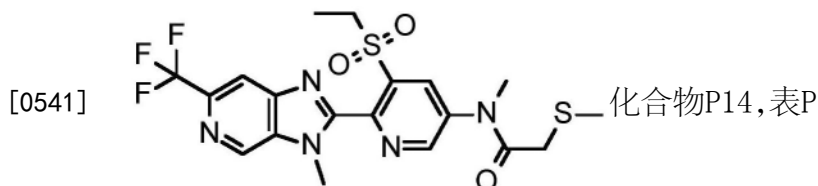
[0536] 方法1:

[0537] 在来自安捷伦科技公司 (Agilent Technologies) 的质谱仪 (6410三重四极杆质谱仪) 上记录光谱,所述质谱仪配备有电喷雾源 (极性:正和负极性转换,毛细管:4.00kV,碎裂电压:100.00V,气体温度:350°C,气体流量:11L/min,喷雾器气体:45psi,质量范围:110-1000Da;DAD波长范围:210-400nm)。柱:KINETEX EVO C18,长度50mm,直径4.6mm,粒度2.6μm。柱烘箱温度40°C。溶剂梯度:A=含0.1%甲酸的水:乙腈 (95:5v/v)。B=含0.1%甲酸的乙腈。梯度=0min 90% A,10% B;0.9-1.8min 0% A,100% B,2.2-2.5min 90% A,10% B。流速1.8mL/min。

[0538] 方法2:

[0539] 在来自沃特斯公司 (Waters) 的质谱仪 (Acquity SDS质谱仪) 上记录光谱,所述质谱仪配备有电喷雾源 (极性:正和负极性转换,毛细管:3.00kV,锥孔电压:41.00V,源温度:150°C,去溶剂化气体流量:1000L/Hr,去溶剂化温度:500°C,锥孔气体流量:50L/hr,质量范围:110-800Da;PDA波长范围:210-400nm)。柱:Acquity UPLC HSS T3 C18,长度30mm,直径2.1mm,粒度1.8μm。柱烘箱温度40°C。溶剂梯度:A=含0.1%甲酸的水:乙腈 (95:5v/v)。B=含0.05%甲酸的乙腈。梯度=0min 90% A,10% B;0.2min 50% A,50% B;0.7min-1.3min 0% A,100% B;1.4-1.6min 90% A,10% B。流速0.6mL/min。

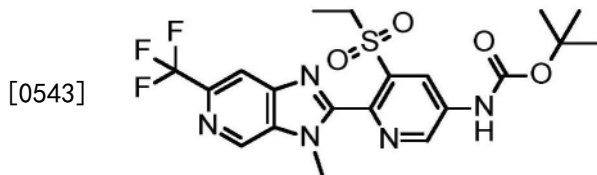
[0540] 实例H1:N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-2-甲基硫烷基-乙酰胺 (化合物P14,表P) 的制备



[0542] 步骤A:N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-



## 3-吡啶基]氨基甲酸叔丁酯的制备

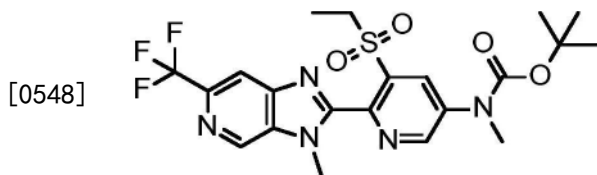


[0544] 向2-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶(1500mg, 3.339mmol, 如在WO 2016/005263中所述制备)在1,4-二噁烷(8g)中的溶液中添加氨基甲酸叔丁酯(474mg, 4.007mmol)、碳酸铯(1.52g, 4.675mmol)和XPhos(286mg, 0.6011mmol)。将反应混合物用氩气脱气10分钟并且然后添加乙酸钯(II)(45mg, 0.2004mmol)。将反应混合物在微波条件下在110℃下加热45分钟。将得到的混合物用乙酸乙酯稀释并过滤。将有机层用水和盐水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并蒸发,以提供N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氨基甲酸叔丁酯。

[0545] LCMS(方法1): 486(M+H), Rt 1.03min。

[0546]  $^1\text{H NMR}$  (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm 1.38(t,  $J=7.34\text{Hz}$ , 3H) 1.58(s, 9H) 3.80(q,  $J=7.46\text{Hz}$ , 2H) 3.89(s, 3H) 7.65-7.71(m, 1H) 8.12(s, 1H) 8.63(d,  $J=2.20\text{Hz}$ , 1H) 8.97-8.98(m, 1H) 9.04-9.13(m, 1H)。

[0547] 步骤B: N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-氨基甲酸叔丁酯的制备

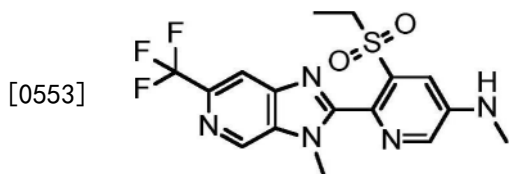


[0549] 在室温下向N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氨基甲酸叔丁酯(15g, 30.90mmol)在N,N-二甲基甲酰胺(150mL)中的搅拌溶液中添加碳酸钾(5,124g, 37.08mmol)和碘甲烷(2.32mL, 37.08mmol)。将反应混合物室温搅拌过夜并且然后用冰冷的水(200mL)淬灭。将所需化合物沉淀出。将沉淀物在布氏漏斗上过滤,用水(100mL)、正戊烷(50mL)洗涤并且然后在高真空下干燥,以提供呈白色固体的N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-氨基甲酸叔丁酯。

[0550] LCMS(方法2): Rt 1.52min, 500(M+H)。

[0551]  $^1\text{H NMR}$  (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm 1.35-1.42(m, 3H) 1.51(s, 9H) 3.45(s, 3H) 3.77-3.85(m, 2H) 3.90(s, 3H) 8.11(s, 1H) 8.43-8.47(m, 1H) 8.96(s, 1H) 8.99-9.04(m, 1H)。

[0552] 步骤D: 5-乙基磺酰基-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺的制备



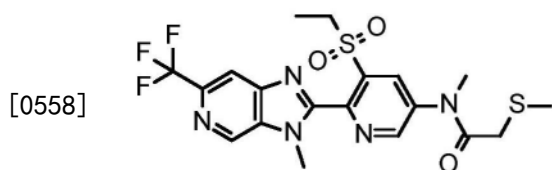
[0554] 将N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡

啶基]-N-甲基-氨基甲酸叔丁酯(7g,14.01mmol)溶解在二氯甲烷(100mL)中并添加2,2,2-三氟乙酸(20mL)并观察到气体形成。将反应搅拌过夜。将溶剂除去并将混合物用饱和碳酸钾溶液中和。将所形成的沉淀物过滤,用水和环己烷洗涤并且然后在减压下干燥,以提供5-乙基磺酰基-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺。

[0555] LCMS(方法2):Rt:0.85min,401(M+H)。

[0556]  $^1\text{H NMR}$  (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm 1.37 (t,  $J=7.46\text{Hz}$ , 3H) 3.05 (s, 3H) 3.74 (q,  $J=7.42\text{Hz}$ , 2H) 3.87 (s, 3H) 5.32 (s, 1H) 7.55 (d,  $J=2.81\text{Hz}$ , 1H) 8.13 (s, 1H) 8.30 (d,  $J=2.69\text{Hz}$ , 1H) 8.98 (s, 1H)。

[0557] 步骤E:N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-2-甲基硫烷基-乙酰胺(化合物P14,表P)的制备



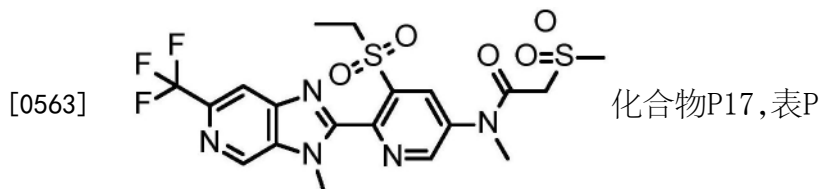
化合物 P14, 表 P

[0559] 在低温下向2-甲基硫烷基乙酸(0.4mL,4.7mmol)在二氯甲烷(5mL)和一滴N,N-二甲基甲酰胺(催化量)中的无色透明溶液中逐滴添加草酰二氯(0.62mL,7mmol)。将所得混合物在室温下搅拌1小时直至完成。将反应混合物在室温下在减压下蒸发,以提供2-甲基硫烷基乙酰氯。在氮气下,将5-乙基磺酰基-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺(0.5g,1.3mmol)溶解在四氢呋喃(5mL)中,添加N,N-二乙基乙胺(0.21mL,1.5mmol)并将所得混合物在0℃下冷却。将2-甲基硫烷基乙酰氯(0.16g,1.3mmol)溶解在四氢呋喃(3mL)中的溶液逐滴添加到所述溶液中。将反应混合物在室温下搅拌16小时,然后倒入冷水(30ml)中。将所得溶液用乙酸乙酯萃取并将合并的有机层用饱和氯化钠水溶液(30ml)洗涤,经无水硫酸钠干燥,并在减压下浓缩。将粗品通过硅胶色谱法纯化,以提供N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-2-甲基硫烷基-乙酰胺。

[0560] LCMS(方法2):Rt:0.94min,488(M+H)。

[0561]  $^1\text{H NMR}$  (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm 1.35-1.46 (m, 3H) 2.29 (s, 3H) 3.20-3.47 (m, 2H) 3.56 (br s, 3H) 3.81-3.96 (m, 5H) 8.01-8.25 (m, 1H) 8.36-8.58 (m, 1H) 8.87-9.18 (m, 2H)。

[0562] 实例H2:N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-2-甲基磺酰基-乙酰胺(实例P17,表P)的制备



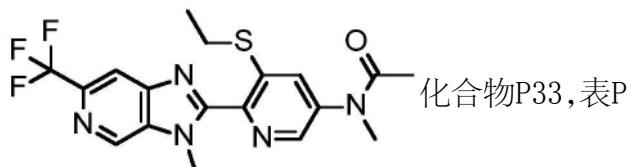
[0564] 向0℃下的N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-2-甲基硫烷基-乙酰胺(0.31mmol,0.15g)在二氯甲烷(2mL)中的透明无色溶液中缓慢添加3-氯过苯甲酸(0.68mmol,0.12g)。在15分钟后,在室温下将反应混合物升温并搅拌2小时。完成后,通过添加饱和碳酸氢钠水溶液将反应混合物淬灭。将所得

混合物用二氯甲烷萃取。将合并的有机层用饱和碳酸氢钠水溶液 (30ml) 洗涤, 经无水硫酸钠干燥, 并在减压下浓缩。将残余物通过色谱法纯化, 以得到N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-2-甲基磺酰基-乙酰胺。

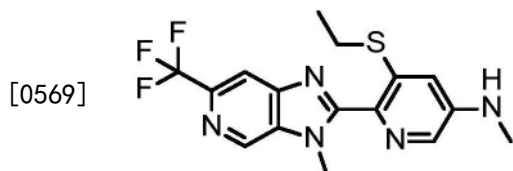
[0565] LCMS(方法2): Rt 0.83min, 520(M+H)。

[0566]  $^1\text{H NMR}$  (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm 1.41 (t, 3H) 1.92-2.10 (m, 1H) 3.23 (s, 3H) 3.51 (br s, 2H) 3.60-3.83 (m, 1H) 3.83-4.00 (m, 6H) 4.10-4.52 (m, 1H) 4.36 (br s, 1H) 8.03-8.26 (m, 1H) 8.32-8.79 (m, 1H) 8.86-9.13 (m, 2H)。

[0567] 实例H3: N-[5-乙基磺烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙酰胺(化合物P33, 表P)的制备



[0568] 步骤A: 5-乙基磺烷基-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺的制备

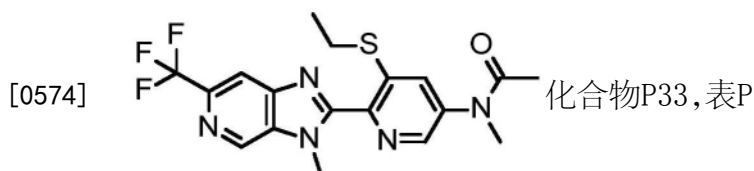


[0570] 在干燥容器中, 将2-(5-溴-3-乙基磺烷基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶 (1.0g, 2.4mmol, 如在WO 2016/005263中所述制备) 溶解在四氢呋喃 (3mL) 中。添加铜 (0.03g, 0.48mmol)、硫酸铜 (0.077g, 0.48mmol) 和甲胺 (2.2mL, 24mmol, 在 $\text{H}_2\text{O}$ 中的40%  $\text{MeNH}_2$ )。将容器关闭并在 $100^\circ\text{C}$ 下搅拌直至完成。在室温下冷却后, 释放压力并将反应混合物用水稀释。将水层用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层用水、盐水溶液洗涤, 用无水硫酸钠干燥并在减压下浓缩。将粗品通过色谱法纯化, 以提供5-乙基磺烷基-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺。

[0571] LCMS(方法2): Rt 0.91min, 368(M+H)。

[0572]  $^1\text{H NMR}$  (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm 1.34 (t,  $J=7.34\text{Hz}$ , 3H) 2.90-3.01 (m, 5H) 4.05 (s, 3H) 6.93 (br s, 1H) 8.04 (br d,  $J=8.56\text{Hz}$ , 1H) 8.21 (br d,  $J=1.47\text{Hz}$ , 1H) 8.94 (br s, 1H)。

[0573] 步骤B: N-[5-乙基磺烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙酰胺(化合物P33, 表P)的制备。



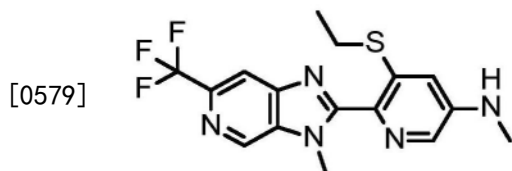
[0575] 在室温下向5-乙基磺烷基-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺 (0.400g, 1.09mmol) 在吡啶 (5mL) 中的悬浮液中添加N,N-二甲基吡啶-4-胺 (0.0269g, 0.218mmol), 然后添加乙酰氯 (0.171g, 2.18mmol)。将所得反应在室温下搅拌16h。将吡啶在真空下浓缩。将水 (20mL) 添加到反应物中并用乙酸乙酯 (10mL x2) 萃取。将

合并的有机层用盐水 (20mL) 洗涤, 在硫酸钠上干燥并在减压下浓缩, 以提供粗化合物。使用 Combi-Flash 硅胶 (在 DCM 中 2% 甲醇) 纯化提供标题化合物。

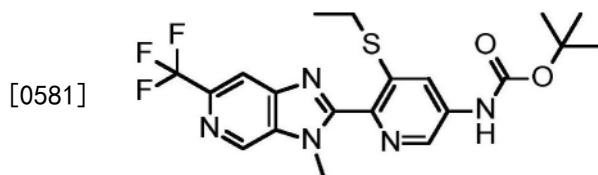
[0576] LCMS (方法 2): Rt 0.87min, 410 (M+H)。

[0577]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$ ppm 1.21 (t, 3H) 2.04 (br s, 3H) 3.06 (q, 2H) 4.02 (s, 3H) 8.04 (m, 1H) 8.28 (m, 1H) 8.59 (d, 1H) 9.25 (s, 1H)。

[0578] 5-乙基硫烷基-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺的替代合成



[0580] 步骤A:N-[5-乙基硫烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氨基甲酸叔丁酯的制备

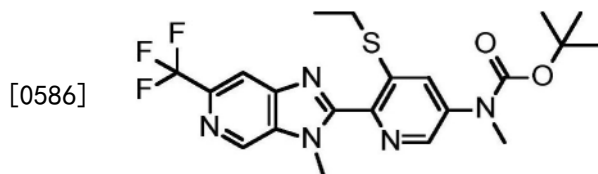


[0582] 向 2-(5-溴-3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶 (10g, 23.97mmol, 如在 WO 2016/005263 中所述制备) 在 1,4-二噁烷 (100mL) 中的溶液中添加氨基甲酸叔丁酯 (3.37g, 28.76mmol)、碳酸铯 (10.94g, 33.56mmol) 和 XPhos (2.09g, 4.314mmol, 98 质量%)。将所得混合物用氩气脱气 30min, 并且然后添加乙酸钡 (II) (0.326g, 1.438mmol)。将所得混合物再次用氩气脱气 10min, 并且然后在 110°C 下搅拌 14-15 小时。将反应混合物冷却至室温并用水 (200mL) 淬灭。将水层用乙酸乙酯 (100mL x 3) 萃取, 并且然后将合并的有机层用盐水 (100mL) 洗涤, 经硫酸钠干燥并在真空中浓缩, 以提供粗化合物。将粗品通过硅胶色谱法纯化, 以提供呈白色固体的纯的 N-[5-乙基硫烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氨基甲酸叔丁酯。

[0583] LCMS (方法 2): Rt 1.11min, 455 (M+H)。

[0584]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm 1.18-1.29 (m, 2H) 1.36 (t,  $J=7.40\text{Hz}$ , 1H) 1.34-1.39 (m, 1H) 1.34-1.39 (m, 1H) 1.55 (s, 9H) 1.72 (s, 3H) 2.05 (s, 1H) 2.94-3.03 (m, 2H) 4.03 (s, 3H) 6.93-7.08 (m, 1H) 8.10-8.21 (m, 1H) 8.16-8.22 (m, 1H) 8.31 (d,  $J=2.20\text{Hz}$ , 1H) 8.93 (s, 1H)。

[0585] 步骤B:N-[5-乙基硫烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-氨基甲酸叔丁酯的制备



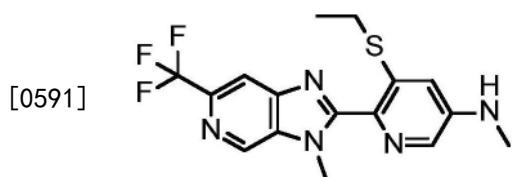
[0587] 向 N-[5-乙基硫烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氨基甲酸叔丁酯 (2g, 4.41mmol) 在 N,N-二甲基甲酰胺 (20mL) 中的溶液中添加碳酸铯 (1.72g, 5.292mmol, 99.995 质量%) 和碘甲烷 (0.333mL, 5.292mmol), 并且然后将反应混合

物在室温下搅拌直至完成。然后将反应混合物用水(200ml)稀释并将水层用乙酸乙酯(3x 100ml)萃取。将合并的有机层经硫酸钠干燥,过滤并在真空中浓缩,以提供呈白色固体的N-[5-乙基硫烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-氨基甲酸叔丁酯。

[0588] LCMS(方法2):Rt 1.11min,468(M+H)。

[0589]  $^1\text{H}$  NMR (DMSO-d<sub>6</sub>)  $\delta$ :9.23(s,1H),8.57(d,J=2.2Hz,1H),8.27(s,1H),7.95(d,J=2.2Hz,1H),4.00(s,3H),3.33(s,3H),3.02(q,J=7.3Hz,2H),1.46(s,9H),1.21(t,J=7.3Hz,3H)。

[0590] 步骤C:5-乙基硫烷基-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺的制备

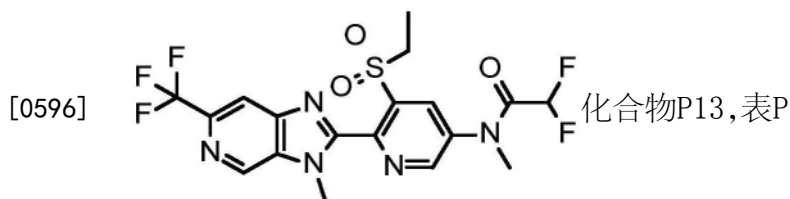


[0592] 向N-[5-乙基硫烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-氨基甲酸叔丁酯(2.2g,4.7mmol)在二氯甲烷(15mL)中的溶液中添加2,2,2-三氟乙酸(0.8g,7.1mmol)。将所得混合物在室温下搅拌过夜。将反应混合物用碳酸氢盐溶液淬灭并将水层用二氯甲烷萃取。将合并的有机层用水、盐水溶液洗涤,用无水硫酸钠干燥并在减压下浓缩,以提供5-乙基硫烷基-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺。

[0593] LCMS(方法2):Rt 0.91min,368(M+H)。

[0594]  $^1\text{H}$  NMR(400MHz,CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ ppm 1.34(t,J=7.34Hz,3H)2.90-3.01(m,5H)4.05(s,3H)6.93(br s,1H)8.04(br d,J=8.56Hz,1H)8.21(br d,J=1.47Hz,1H)8.94(br s,1H)。

[0595] 实例H4:N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2,2-二氟-N-甲基-乙酰胺(化合物P13,表P)的制备

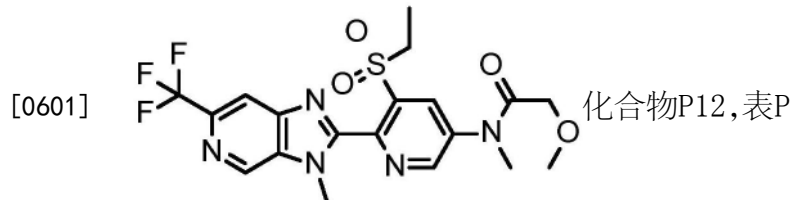


[0597] 在室温下在氮气下将5-乙基磺酰基-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺(0.8mmol,0.3g,如实例P1,步骤D中所述制备)和2,2-二氟乙酸(0.9mmol,0.09g)溶解在吡啶中。将反应混合物冷却(约0°C-10°C)并在氮气下逐滴添加磷酰氯(0.9mmol,0.1g)。将反应混合物在约-10°C至0°C下搅拌30分钟直至完成。将反应混合物在冷水中缓慢淬灭并用乙酸乙酯稀释。将有机层分离并将水层进一步用乙酸乙酯洗涤。将合并的有机层用盐水洗涤,经硫酸钠干燥并在真空中浓缩。将残余物通过硅胶色谱法纯化,以得到N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2,2-二氟-N-甲基-乙酰胺。

[0598] LCMS(方法2):Rt 1.30min,478[M+H]。

[0599]  $^1\text{H NMR}$  (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm 1.34-1.44 (m, 3H) 3.94 (s, 5H) 3.71-4.04 (m, 1H) 5.52-6.93 (m, 1H) 8.03-8.22 (m, 1H) 8.12 (s, 1H) 8.48 (d, 1H) 8.83-9.11 (m, 1H) 8.98 (br d, 1H)。

[0600] 实例H5:N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2-甲氧基-N-甲基-乙酰胺(化合物P12,表P)的制备

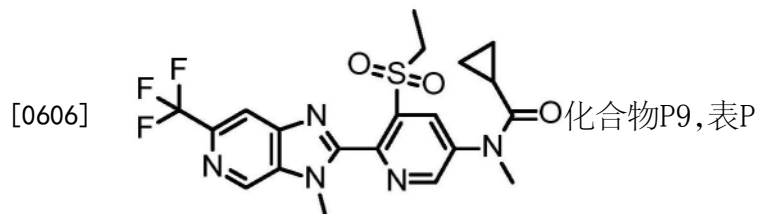


[0602] 将5-乙基磺酰基-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺 (0.5mmol, 0.2g) 溶解在吡啶 (3ml) 中并逐滴添加2-甲氧基乙酰氯 (0.55mmol, 0.052mL)。将反应混合物在室温下搅拌3小时并倒入水 (30ml) 中,将水层用二乙基乙酸乙酯萃取。将合并的有机层用饱和氯化钠水溶液 (30ml) 洗涤,经无水硫酸钠干燥,并在减压下浓缩。将残余物通过色谱法纯化,以提供不纯的N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2-甲氧基-N-甲基-乙酰胺。

[0603] LCMS (方法2) :Rt 0.85min, 472[M+H]。

[0604]  $^1\text{H NMR}$  (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm 1.39 (t, 3H) 1.66 (br s, 1H) 3.41-3.55 (m, 6H) 3.84 (q, 2H) 3.93 (s, 3H) 4.21 (br s, 2H) 8.12 (d, 1H) 8.44 (d, 1H) 9.00 (s, 2H)。

[0605] 实例H6:N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-环丙烷甲酰胺(化合物P9,表P)的制备

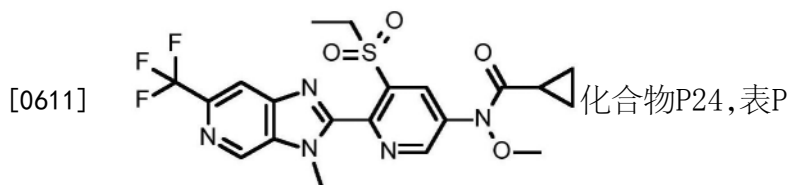


[0607] 将5-乙基磺酰基-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺 (0.50g, 1.3mmol, 在实例H1, 步骤D中所述制备) 溶解在四氢呋喃 (15mL) 中。在室温下逐滴添加N,N-二乙基胺 (3当量, 3.8mmol, 99质量%), 然后逐滴添加环丙烷碳酰氯 (1.6mmol, 0.17g)。将所得反应混合物在室温下搅拌3小时。反应完成后,然后将反应混合物倒入水 (20ml) 中并用乙酸乙酯 (3x 20ml) 萃取。将合并的萃取物用盐水洗涤,用硫酸钠干燥并在减压下蒸发,以给出粗产物。将此粗品通过色谱法纯化,以提供N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-环丙烷甲酰胺

[0608] LCMS (方法2) :Rt 0.86min, 468[M+H]。

[0609]  $^1\text{H NMR}$  (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm 0.90-0.96 (m, 2H) 1.19-1.23 (m, 2H) 1.24-1.31 (m, 1H) 1.35-1.43 (m, 3H) 3.53-3.59 (m, 3H) 3.79-3.87 (m, 2H) 3.94 (s, 3H) 8.12 (s, 1H) 8.43-8.49 (m, 1H) 8.98-9.03 (m, 2H)。

[0610] 实例H7:N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲氧基-环丙烷甲酰胺(化合物P24,表P)的制备

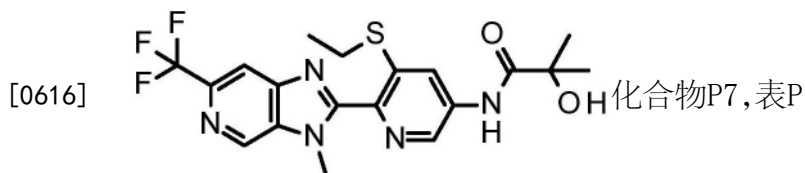


[0612] 将2-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶(250mg, 0.557mmol, 如在W0 2016/005263中所述制备)在甲苯(2.8mL)中的溶液用碳酸铯(363mg, 1.11mmol)和N-甲氧基环丙烷甲酰胺(70mg, 0.612mmol)处理。将反应混合物用氮气脱气10min并且然后添加tert-BuBrettPhos-Pd-G3, [(2-二叔丁基膦基-3,6-二甲氧基-2',4',6'-三异丙基-1,1'-联苯基)-2-(2'-氨基-1,1'-联苯基)]甲磺酸钯(II)(22mg, 0.0278mmol)。将反应混合物第二次脱气10min并且然后在90℃下搅拌一夜。在室温下将反应混合物用水(20mL)和乙酸乙酯(10mL)淬灭。将所得混合物通过硅藻土床过滤,用乙酸乙酯(2x 10ml)洗涤。将两层分离并将有机层用盐水(10ml)洗涤,在硫酸钠上干燥并在真空中浓缩,以提供粗产物。将其通过硅胶色谱法纯化,以提供N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲氧基-环丙烷甲酰胺。

[0613] LCMS(方法2):Rt 1.0min, 484(M+H)。

[0614]  $^1\text{H NMR}$  (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm 1.07-1.14 (m, 2H) 1.21-1.28 (m, 2H) 1.37-1.42 (m, 3H) 2.42-2.48 (m, 1H) 3.77-3.87 (m, 2H) 3.92 (s, 3H) 4.01 (s, 3H) 8.11 (s, 1H) 8.71 (d, J=2.32Hz, 1H) 8.98 (s, 1H) 9.35 (d, J=2.32Hz, 1H)。

[0615] 实例H8:N-[5-乙基硫烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2-羟基-2-甲基-丙酰胺(化合物P7,表P)的制备

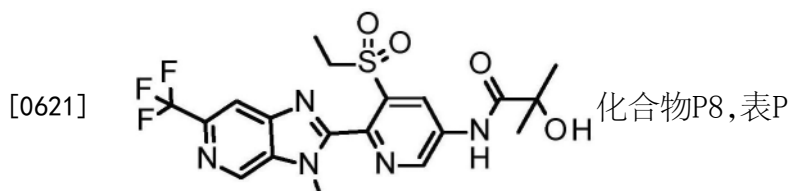


[0617] 将5-乙基硫烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-醇(在W0 2016/005263中所述制备)(0.5g, 1.411mmol)溶解在乙腈(14mL)中。然后添加碳酸铯(1.149g, 3.527mmol),将所得悬浮液搅拌5min并添加2-溴-2-甲基-丙酰胺(可商购的,CAS 7462-74-0)(0.2576g, 1.552mmol)。将得到的反应混合物在70℃下搅拌一夜并在室温下冷却。将溶剂蒸发并将残余物溶解在水和乙酸乙酯中。将水层酸化并且然后用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层经硫酸钠干燥,过滤并在真空中浓缩。将粗产物通过硅胶色谱法纯化,以提供N-[5-乙基硫烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2-羟基-2-甲基-丙酰胺。

[0618] LCMS(方法1):Rt 0.9min, 440(M+H)。

[0619]  $^1\text{H NMR}$  (400MHz,  $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$ ppm 1.26 (t, J=7.34Hz, 3H) 1.41 (s, 6H) 2.97 (q, J=7.34Hz, 2H) 4.00 (s, 3H) 5.89-5.94 (m, 1H) 8.26 (d, J=0.73Hz, 1H) 8.49 (d, J=1.83Hz, 1H) 9.06 (d, J=2.20Hz, 1H) 9.22 (s, 1H) 10.26-10.31 (m, 1H)。

[0620] 实例H9:N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2-羟基-2-甲基-丙酰胺(化合物P8,表P)的制备

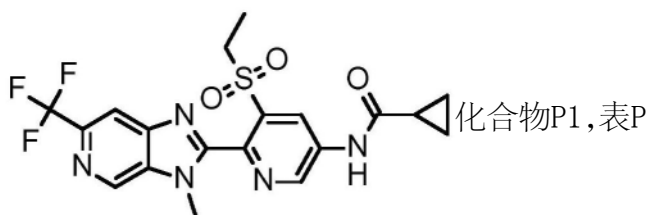


[0622] 将N-[5-乙基硫烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2-羟基-2-甲基-丙酰胺(0.14g,0.3186mmol)溶解在二氯甲烷(2.8mL)中并将得到的溶液在0℃下冷却。然后添加3-氯过苯甲酸(0.1571g,0.6372mmol)(悬浮液)并将反应在0℃下搅拌30',然后在室温下升温并搅拌3小时。悬浮液变成溶液。将反应混合物用NaOH 1M(5mL)和硫代硫酸钠溶液(5mL)淬灭。将水层用二氯甲烷萃取3次。将合并的有机层用NaOH 1M洗涤2次,用盐水洗涤,经Na2SO4干燥,过滤并在真空中浓缩,以给出N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2-羟基-2-甲基-丙酰胺。

[0623] LCMS(方法1):Rt 0.83min,472(M+H)。

[0624] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,DMSO-d<sub>6</sub>)δppm 1.21(t,J=7.52Hz,3H)1.43(s,6H)3.78(q,J=7.34Hz,2H)3.86(s,3H)5.92(s,1H)8.28(d,J=0.73Hz,1H)9.10(d,J=2.57Hz,1H)9.27(s,1H)9.44(d,J=2.20Hz,1H)10.65-10.69(m,1H)。

[0625] 实例H10:N-[5-乙基硫烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]环丙烷甲酰胺(化合物P1,表P)的制备

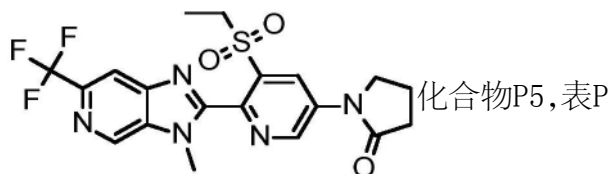


[0626] 在室温下向氩气下的2-(5-溴-3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶(0.5g,1.198mmol,如在WO 2016/005263中所述制备)、环丙烷甲酰胺(104.1mg,1.198mmol)、碳酸铯(1.367g,4.195mmol)和(5-二苯基膦基-9,9-二甲基-咕吨-4-基)-二苯基-磷烷(0.03575g,0.05992mmol;xantphos)在1,4-二噁烷(9.6mL)中的溶液中添加(1E,4E)-1,5-二苯基戊-1,4-二烯-3-酮;钯(0.01131g,0.01198mmol;Pd(dba)<sub>2</sub>)。将混合物在95℃下加热总计两天,添加另外的Xantphos(两次,0.05当量)和双(二亚苄基丙酮)钯(0)(两次,0.1当量)。用水稀释后,将产物用乙酸乙酯萃取,将合并的有机层用无水硫酸镁干燥并在减压下浓缩。使用combiflash硅胶将残余物纯化,以提供呈固体的N-[5-乙基硫烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]环丙烷-甲酰胺。

[0627] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,CDC1<sub>3</sub>)δppm 0.96(dq,J=7.61,3.82Hz,2H)1.13-1.20(m,2H)1.35(t,J=7.34Hz,3H)1.60-1.66(m,1H)2.97(q,J=7.58Hz,2H)4.03(s,3H)7.94(s,1H)8.18(s,1H)8.34(d,J=2.20Hz,1H)8.45(d,J=2.20Hz,1H)8.94(s,1H)。

[0628] 实例H11:1-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]吡咯烷-2-酮(化合物P5,表P)的制备



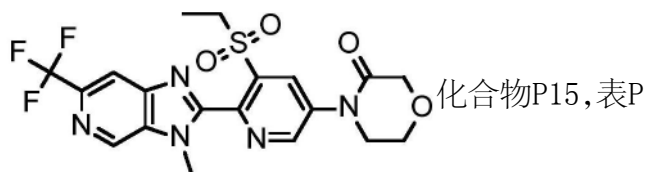


[0629] 向在微波小瓶中的2-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶(100mg,0.223mmol,如在WO 2016/005263中所述制备)在1,4-二噁烷(5mL)中的溶液中添加吡咯烷-2-酮(1.2当量,0.267mmol)、碳酸铯(1.4当量,0.312mmol)和XPhos(0.18当量,0.040mmol)。将混合物用氩气冲洗30分钟,然后添加乙酸钡(II)(0.06当量,0.013mmol),给小瓶加盖并将反应混合物在110℃下在微波中加热20分钟,并进一步用常规加热回流14小时。用水稀释后,将混合物通过烧结漏斗过滤并将固体残余物用乙酸乙酯和水洗涤。将滤液层分离,将有机层用盐水洗涤,在硫酸钠上干燥,过滤并在减压下浓缩。使用combiflash硅胶(二氯甲烷中的2%甲醇)将残余物纯化,以提供呈固体的1-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]吡咯烷-2-酮。

[0630] LCMS(方法2):Rt 0.90min,454(M+H)。

[0631]  $^1\text{H NMR}$  (400MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$ ppm 1.17 (t,  $J=7.40\text{Hz}$ , 3H) 2.15 (quin,  $J=7.52\text{Hz}$ , 2H) 2.30 (s, 1H) 2.60 (t,  $J=8.07\text{Hz}$ , 2H) 3.74-3.82 (m, 2H) 3.82-3.85 (m, 3H) 4.02 (t,  $J=7.03\text{Hz}$ , 2H) 8.26-8.28 (m, 1H) 8.28-8.30 (m, 1H) 9.01 (d,  $J=2.45\text{Hz}$ , 1H) 9.19 (d,  $J=2.45\text{Hz}$ , 1H) 9.25 (s, 1H)。

[0632] 实例H12:4-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]吗啉-3-酮(化合物P15,表P)的制备

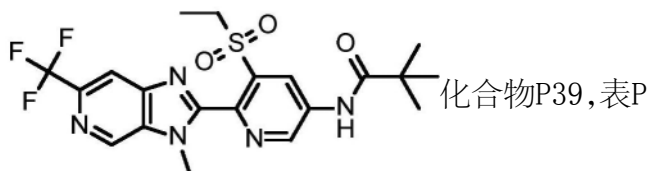


[0633] 向在微波小瓶中的2-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶(400mg,0.891mmol,如在WO 2016/005263中所述制备)在1,4-二噁烷(2mL)中的溶液中添加吗啉-3-酮(1.2当量,1.069mmol)、碳酸铯(1.4当量,1.247mmol)和Xantphos(0.14当量,0.125mmol)。将混合物用氩气冲洗15分钟,添加三(二亚苄基丙酮)二钯(0)  $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$  (0.03当量,0.0267mmol),给小瓶加盖并在微波中在110℃下加热120分钟。用水稀释后,将产物用乙酸乙酯萃取,将合并的有机层经硅藻土床过滤,用无水硫酸钠干燥并在减压下浓缩。使用combiflash硅胶(环己烷中的70%乙酸乙酯)将残余物纯化,以提供呈固体的4-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]吗啉-3-酮。

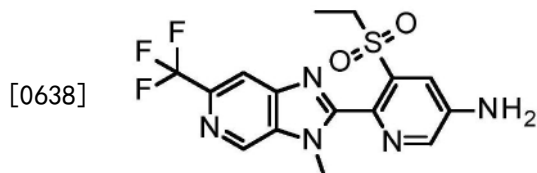
[0634] LCMS(方法2):Rt 0.85min,470(M+H)。

[0635]  $^1\text{H NMR}$  (400MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$ ppm 1.22 (t,  $J=7.40\text{Hz}$ , 3H) 3.80 (q,  $J=7.30\text{Hz}$ , 2H) 3.89 (s, 3H) 4.03-4.09 (m, 4H) 4.35 (s, 2H) 8.30 (s, 1H) 8.71 (d,  $J=2.20\text{Hz}$ , 1H) 9.25 (d,  $J=2.20\text{Hz}$ , 1H) 9.29 (s, 1H)。

[0636] 实例H13:N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2,2-二甲基-丙酰胺(化合物P39,表P)的制备



[0637] 步骤A:5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺的制备

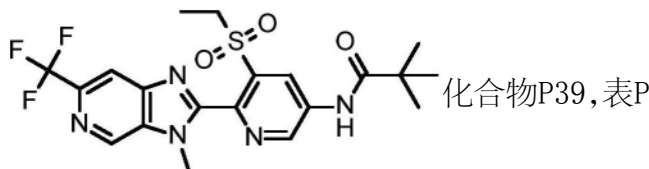


[0639] 向N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]氨基甲酸叔丁酯(10g,20.60mmol;以上在实例H1,步骤A中描述的)在二氯甲烷(100mL)中的溶液中添加2,2,2-三氟乙酸(20mL,259.6mmol)并将反应混合物在室温下搅拌过夜。将混合物用碳酸氢钠水溶液淬灭,将产物用乙酸乙酯(3x 50ml)萃取,将合并的有机层经硫酸钠干燥,过滤并在减压下浓缩。将残余物通过combiflash(硅胶,50%乙酸乙酯-环己烷)纯化,以提供5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺。

[0640] LCMS(方法1):Rt 1.25min,386(M+H)。

[0641]  $^1\text{H NMR}$  (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  = 9.20 (s, 1H), 8.31 (d, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.59 (d, 1H), 6.35-5.86 (m, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.79-3.71 (m, 2H), 1.18 (t, 3H)。

[0642] 步骤B:N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2,2-二甲基-丙酰胺(化合物P39,表P)的制备

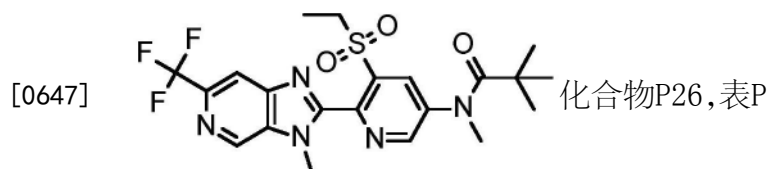


[0643] 向在0°C下在氮气下的5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺(400mg,1.038mmol)在二氯甲烷(6mL)和四氢呋喃(6mL)的混合物中的溶液中添加三乙胺(1.5当量,1.557mmol),然后逐滴添加2,2-二甲基丙酰氯(1.2当量,1.245mmol)并将反应混合物在室温下搅拌过夜。添加二氯甲烷和水,将层分离,将有机相经无水硫酸钠干燥并在真空中浓缩。将残余物通过combiflash(环己烷中的40%乙酸乙酯)纯化,以提供呈固体的N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2,2-二甲基-丙酰胺。

[0644] LCMS(方法2):Rt 1.00min,470(M+H)。

[0645]  $^1\text{H NMR}$  (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm 1.28-1.31 (m, 12H) 3.71-3.78 (m, 2H) 3.81 (s, 3H) 7.75 (s, 1H) 8.03 (s, 1H) 8.57 (d, J=2.20Hz, 1H) 8.89 (s, 1H) 9.30 (d, J=2.32Hz, 1H)。

[0646] 实例H14:N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N,2,2-三甲基-丙酰胺(化合物P26,表P)的制备



[0648] 向N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2,2-二甲基-丙酰胺(0.3g,0.639mmol;上述化合物P39)在N,N-二甲基甲酰胺(2mL)中的溶液中添加碳酸铯(1.3当量,0.831mmol),然后添加碘甲烷(1.3当量,0.831mmol)并将反应混合物在室温下搅拌过夜。添加水并将产物用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层用水和盐水洗涤,经无水硫酸钠干燥并在减压下浓缩。将残余物通过combiflash(环己烷中的40%乙酸乙酯)纯化,以提供呈固体的N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N,2,2-三甲基-丙酰胺。

[0649] LCMS(方法2):Rt 0.99min,484(M+H)。

[0650]  $^1\text{H NMR}$  (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm 1.25(s,9H) 1.31(t,  $J=7.34\text{Hz}$ ,3H) 3.47(s,3H) 3.77(q,  $J=7.17\text{Hz}$ ,2H) 3.85(s,3H) 8.04(s,1H) 8.32(s,1H) 8.82(s,1H) 8.92(s,1H)。

[0651] 表P:具有式(I)的化合物的实例

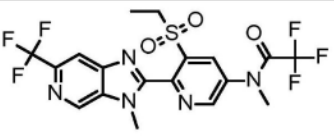
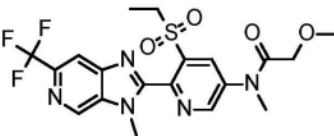
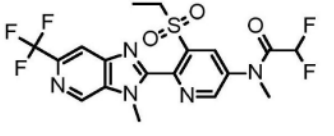
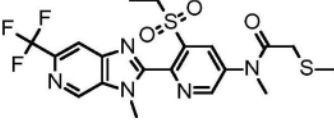
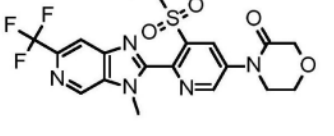
[0652]

条目	IUPAC 名称	结构	RT (min)	[M + H]	方法	MP °C
P1	N-[5-乙基硫烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]环丙烷甲酰胺		0.93	422	1	-
P2	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]环丙烷甲酰胺		0.89	454	1	311.7-316.6
P3	N-[3-乙基磺酰基-4-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯基]-2,2,2-三氟-乙酰胺		-	-	-	260-260
P4	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]乙酰胺		1.30	428	1	124-126
P5	1-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]吡咯烷-2-酮		0.90	454	2	297-299

条目	IUPAC 名称	结构	RT (min)	[M + H]	方法	MP °C
P6	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙酰胺		1.25	442	1	213-215
P7	N-[5-乙基硫烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2-羟基-2-甲基-丙酰胺		0.87	440	1	195-196
P8	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2-羟基-2-甲基-丙酰胺		0.85	472	1	222-225
P9	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-环丙烷甲酰胺		0.96	468	2	172-174
P10	N-环丙基-N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]乙酰胺		1.36	468	1	111-113

[0653]

[0654]

条目	IUPAC 名称	结构	RT (min)	[M + H]	方法	MP °C
P11	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2,2,2-三氟-N-甲基-乙酰胺		1.41	496	1	186-188
P12	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2-甲氧基-N-甲基-乙酰胺		0.83	472	2	148-150
P13	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2,2-二氟-N-甲基-乙酰胺		1.32	478	1	200-202
P14	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-2-甲基硫烷基-乙酰胺		0.91	488	2	178-180
P15	4-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]		0.85	470	2	244-246

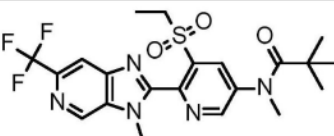
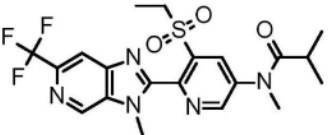
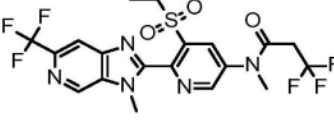
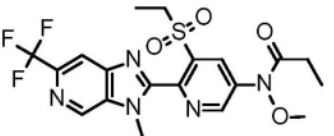
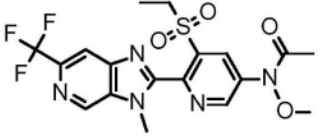
[0655]

条目	IUPAC 名称	结构	RT (min)	[M + H]	方法	MP °C
P16	N-[3-乙基磺酰基-4-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯基]-N-甲基-乙酰胺		1.153	442	1	223-225
P17	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-2-甲基磺酰基-乙酰胺		0.83	520	2	248-250
P18	4-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-1,1-二氧化-1,4-噻嗪烷-3-酮		0.84	518	2	180-182
P19	4-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]硫代吗啉-3-酮		0.90	486	2	211-213
P20	2-氯-N-乙基-N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]		0.94	490/492	2	169-171

[0656]

条目	IUPAC 名称	结构	RT (min)	[M + H]	方法	MP °C
	基]乙酰胺					
P21	N-乙基-N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]乙酰胺		0.86	456	2	163-165
P22	2-氯-N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙酰胺		0.92	476/478	2	192-194
P23	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-丙酰胺		0.91	456	2	149-151
P24	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲氧基-环丙烷甲酰胺		1.02	484	2	182-184
P25	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]丙酰胺		0.89	442	2	252-254



条目	IUPAC 名称	结构	RT (min)	[M + H]	方法	MP °C
P26	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N,2,2-三甲基-丙酰胺		0.99	484	2	137-139
P27	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N,2-二甲基-丙酰胺		0.92	470	2	122-124
P28	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-3,3,3-三氟-N-甲基-丙酰胺		0.96	510	2	203-205
P29	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲氧基-丙酰胺		0.98	472	2	133-135
P30	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲氧基-乙酰胺		0.94	458	2	187-189

[0657]

[0658]

条目	IUPAC 名称	结构	RT (min)	[M + H]	方法	MP °C
P31	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-3-甲基磺酰基-丙酰胺		0.81	534	2	220-222
P32	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-(2,2,2-三氟乙基)丙酰胺		1.447	524	1	106-108
P33	N-[5-乙基硫烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-乙酰胺		0.83	472	2	176-178
P34	3-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]噁唑烷-2-酮		0.85	456	2	244-246
P35	1-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-3-甲氧基		0.88	485	2	238-240

条目	IUPAC 名称	结构	RT (min)	[M + H]	方法	MP °C
	-咪唑烷-2-酮					
P36	1-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]咪唑烷-2-酮		0.80	455	2	246-248
P37	1-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-3-甲基-咪唑烷-2-酮		1.32	469	1	255-257
P38	1-氟基-N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-环丙烷甲酰胺		0.92	493	2	216-218
P39	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2,2-二甲基-丙酰胺		0.98	470	2	136-138
P40	N-环丙基-N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]		0.91	482	2	219-221

[0659]

[0660]

条目	IUPAC 名称	结构	RT (min)	[M + H]	方法	MP °C
	基]丙酰胺					
P41	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-3-甲基硫烷基-丙酰胺		0.91	502	2	189-191
P42	N-(1-氟基环丙基)-N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]乙酰胺		0.88	493	2	195-198
P43	2-氟基-N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N,2-二甲基-丙酰胺		0.90	495	2	176-178
P44	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-2,2,2-三氟-乙酰胺		0.95	482	2	226-228
P45	3-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶		0.96	472	2	231-233

条目	IUPAC 名称	结构	RT (min)	[M + H]	方法	MP °C
	基]噻唑烷-2-酮					
[0661] P46	N-[5-乙基磺酰基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-异丙基-乙酰胺		0.98	470	2	108-110
P47	N-[5-乙基硫烷基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-异丙基-乙酰胺		1.01	438	2	148-150

[0662] 通过添加其他杀昆虫、杀螨和/或杀真菌活性的成分,根据本发明的组合物的活性可以显著地加宽,并且适合于普遍情况。具有式I的化合物与其他杀昆虫、杀螨和/或杀真菌活性的成分的混合物还可以具有另外的出人意料的优点,这些优点还可以在更宽的意义上描述为协同活性。例如,植物的更好的耐受性、降低的植物毒性、昆虫可以在它们的不同发育阶段得到控制、或者在它们的生产期间(例如,在研磨或者混合期间,在它们的储存期间或它们的使用期间)的更好的行为。

[0663] 在这里,适当添加的活性成分是例如以下类别的活性成分的代表:有机磷化合物、硝基苯酚衍生物、硫脲、保幼激素、甲脒、二苯甲酮衍生物、脲类、吡咯衍生物、氨基甲酸酯、拟除虫菊酯、氯化烃、酰基脲、吡啶基亚甲基氨基衍生物、大环内酯类、新烟碱以及苏芸金芽孢杆菌制剂。

[0664] 具有式I的化合物与活性成分的以下混合物是优选的(缩写“TX”意指“选自下组的一种化合物,所述组由描述于表A-1至A-17和B-1至B-2和表P中的本发明的化合物组成”):

[0665] 辅助剂-所述辅助剂选自由以下组成的物质组:石油(别名)(628)+TX,

[0666] 杀螨剂-所述杀螨剂选自由以下组成的物质组:1,1-双(4-氯苯基)-2-乙氧基乙醇(IUPAC名称)(910)+TX、2,4-二氯苯基苯磺酸酯(IUPAC/化学文摘名)(1059)+TX、2-氟-N-甲基-N-1-萘乙酰胺(IUPAC名称)(1295)+TX、4-氯苯基苯基砒(IUPAC名称)(981)+TX、阿维菌素(1)+TX、灭螨醌(3)+TX、乙酰虫腈[CCN]+TX、氟丙菊酯(9)+TX、涕灭威(16)+TX、涕灭威(863)+TX、 $\alpha$ -氯氰菊酯(202)+TX、赛硫磷(870)+TX、磺胺螨酯[CCN]+TX、氨基硫代盐(872)+TX、胺吸磷(875)+TX、胺吸磷草酸氢盐(875)+TX、双甲脒(24)+TX、杀螨特(881)+TX、三氧化二砷(882)+TX、AVI 382(化合物代码)+TX、AZ 60541(化合物代码)+TX、益棉磷(44)+TX、保棉磷(azinphos-methyl)(45)+TX、偶氮苯(IUPAC名称)(888)+TX、三唑锡(azacyclotin)(46)+TX、偶氮磷(azothoate)(889)+TX、苯菌灵(62)+TX、苯诺沙磷(benoxafos)(别名)[CCN]+TX、苯螨特(benzoximate)(71)+TX、苯甲酸苄酯(IUPAC名称)[CCN]+TX、联苯腈酯

(74)+TX、氟氯菊酯(76)+TX、乐杀螨(907)+TX、溴灭菊酯(别名)+TX、溴烯杀(bromocyclene)(918)+TX、溴硫磷(920)+TX、乙基溴硫磷(921)+TX、溴螨酯(bromopropylate)(94)+TX、噻嗪酮(99)+TX、丁酮威(103)+TX、丁酮砒威(104)+TX、丁基吡啶灵(butylpyridaben)(别名)+TX、石硫合剂(calcium polysulfide)(IUPAC名称)(111)+TX、毒杀芬(camphchechlor)(941)+TX、氯灭杀威(carbanolate)(943)+TX、甲萘威(115)+TX、克百威(carbofuran)(118)+TX、卡波硫磷(947)+TX、CGA 50'439(研究代码)(125)+TX、灭螨猛(chinomethionat)(126)+TX、杀螨醚(chlorbenside)(959)+TX、杀虫脒(964)+TX、杀虫脒盐酸盐(964)+TX、溴虫腈(130)+TX、敌螨(968)+TX、杀螨酯(chlorfenson)(970)+TX、敌螨特(chlorfensulfide)(971)+TX、氯芬磷(131)+TX、乙酯杀螨醇(chlorobenzilate)(975)+TX、伊托明(chloromebuform)(977)+TX、灭虫脒(chloromethiuron)(978)+TX、丙酯杀螨醇(chloropropylate)(983)+TX、毒死蜱(145)+TX、甲基毒死蜱(146)+TX、虫螨磷(chlorthiophos)(994)+TX、瓜菊酯(cinerin)I(696)+TX、瓜菊酯II(696)+TX、瓜菊酯(cinerins)(696)+TX、四螨嗪(158)+TX、克罗散泰[CCN]+TX、蝇毒磷(174)+TX、克罗米通[CCN]+TX、巴毒磷(crotoxyphos)(1010)+TX、硫杂灵(1013)+TX、果虫磷(cyanthoate)(1020)+TX、丁氟螨酯(CAS登记号:400882-07-7)+TX、三氟氯氰菊酯(196)+TX、三环锡(199)+TX、氯氰菊酯(cypermethrin)(201)+TX、DCPM(1032)+TX、DDT(219)+TX、田乐磷(demephion)(1037)+TX、田乐磷-0(1037)+TX、田乐磷-S(1037)+TX、内吸磷(demeton)(1038)+TX、内吸磷-甲基(224)+TX、内吸磷-0(1038)+TX、内吸磷-0-甲基(224)+TX、内吸磷-S(1038)+TX、内吸磷-S-甲基(224)+TX、磺吸磷(demeton-S-methylsulfon)(1039)+TX、丁醚脒(226)+TX、dimpropyridaz+TX、氯亚胺硫磷(dialifos)(1042)+TX、二嗪磷(227)+TX、抑菌灵(230)+TX、敌敌畏(236)+TX、二克磷(dicliphos)(别名)+TX、开乐散(242)+TX、百治磷(243)+TX、除螨灵(1071)+TX、甲氟磷(dimefox)(1081)+TX、乐果(262)+TX、二活菌素(dinacti)(653)+TX、消螨酚(dinex)(1089)+TX、消螨酚(dinex-diclexine)(1089)+TX、消螨通(dinobuton)(269)+TX、敌螨普(dinocap)(270)+TX、敌螨普-4[CCN]+TX、敌螨普-6[CCN]+TX、邻敌螨消(1090)+TX、硝戊酯(dinopenton)(1092)+TX、硝辛酯杀螨剂(dinosulfon)(1097)+TX、硝丁酯(dinoterbon)(1098)+TX、敌杀磷(1102)+TX、磺基二苯(IUPAC名称)(1103)+TX、戒酒硫[CCN]+TX、乙拌磷(278)+TX、DNOC(282)+TX、苯氧炔螨(dofenapyn)(1113)+TX、多拉克汀(别名)[CCN]+TX、硫丹(294)+TX、因毒磷(endothion)(1121)+TX、EPN(297)+TX、依立诺克丁(别名)[CCN]+TX、乙硫磷(309)+TX、益硫磷(ethoate-methyl)(1134)+TX、乙螨唑(etoxazole)(320)+TX、乙嘧硫磷(etrimfos)(1142)+TX、抗螨唑(fenazafloor)(1147)+TX、啞螨醚(328)+TX、苯丁锡(fenbutatin oxide)(330)+TX、苯硫威(fenothiocarb)(337)+TX、甲氰菊酯(342)+TX、fenpyrad+TX、啞螨酯(fenpyroximate)(345)+TX、除螨酯(fenson)(1157)+TX、氟硝二苯胺(fentrifanil)(1161)+TX、氰戊菊酯(349)+TX、氟虫腈(354)+TX、啞螨酯(flucacrypyrim)(360)+TX、啞蜱脒(1166)+TX、氟螨啉(flubenzimine)(1167)+TX、氟螨脒(366)+TX、氟氰戊菊酯(flucythrinate)(367)+TX、联氟螨(fluenetil)(1169)+TX、氟虫脒(370)+TX、氟氯苯菊酯(flumethrin)(372)+TX、氟杀螨(fluorbenside)(1174)+TX、氟胺氰菊酯(flualinate)(1184)+TX、FMC 1137(研究代码)(1185)+TX、伐虫脒(405)+TX、伐虫脒盐酸盐(405)+TX、安硫磷(formothion)(1192)+TX、胺甲威(formparanate)(1193)+TX、 $\gamma$ -HCH(430)+TX、果绿定(glyodin)(1205)+TX、苜螨醚(halfenprox)(424)+TX、庚烯醚(heptenophos)(432)+TX、十

六烷基环丙烷羧酸酯(IUPAC/化学文摘名)(1216)+TX、噻螨酮(441)+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、水胺硫磷(isocarbophos)(别名)(473)+TX、异丙基O-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸酯(IUPAC名称)(473)+TX、伊维菌素(别名)[CCN]+TX、茉莉菊酯(jasmolin)I(696)+TX、茉莉菊酯II(696)+TX、碘硫磷(jodfenphos)(1248)+TX、林旦(430)+TX、氯芬奴隆(490)+TX、马拉硫磷(492)+TX、丙螨氰(malonoben)(1254)+TX、灭蚜磷(mecarbam)(502)+TX、二噻磷(mephosfolan)(1261)+TX、甲硫芬(别名)[CCN]+TX、虫螨畏(methacrifos)(1266)+TX、甲胺磷(527)+TX、杀扑磷(529)+TX、灭虫威(530)+TX、灭多虫(531)+TX、溴甲烷(537)+TX、速灭威(metolcarb)(550)+TX、速灭磷(556)+TX、自克威(mexacarbate)(1290)+TX、灭螨菌素(557)+TX、米尔贝肟(milbemycin oxime)(别名)[CCN]+TX、丙胺氟(mipafos)(1293)+TX、久效磷(561)+TX、茂果(morphothion)(1300)+TX、莫昔克丁(别名)[CCN]+TX、二溴磷(naled)(567)+TX、NC-184(化合物代码)+TX、NC-512(化合物代码)+TX、氟蚁灵(nifluridide)(1309)+TX、尼可霉素(别名)[CCN]+TX、戊氰威(nitrilacarb)(1313)+TX、戊氰威(nitrilacarb)1:1氯化锌络合物(1313)+TX、NNI-0101(化合物代码)+TX、NNI-0250(化合物代码)+TX、氧乐果(omethoate)(594)+TX、杀线威(602)+TX、亚异砒磷(oxydeprofos)(1324)+TX、砒拌磷(oxydisulfoton)(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、对硫磷(615)+TX、苜氯菊酯(626)+TX、石油油料(别名)(628)+TX、芬硫磷(1330)+TX、稻丰散(631)+TX、甲拌磷(636)+TX、伏杀磷(637)+TX、硫环磷(phosfolan)(1338)+TX、亚胺硫磷(638)+TX、磷胺(639)+TX、辛硫磷(642)+TX、甲基嘧啶磷(652)+TX、氯化松节油(polychloroterpenes)(传统名称)(1347)+TX、杀螨素(polynactins)(别名)(653)+TX、丙氯诺(1350)+TX、丙溴磷(662)+TX、蜚虱威(promacyl)(1354)+TX、克螨特(671)+TX、胺丙畏(propetamphos)(673)+TX、残杀威(678)+TX、乙噻唑磷(prothidathion)(1360)+TX、发硫磷(prothoate)(1362)+TX、除虫菊酯I(696)+TX、除虫菊酯II(696)+TX、除虫菊酯(pyrethrins)(696)+TX、啞螨灵(699)+TX、啞啉硫磷(pyridaphenthion)(701)+TX、嘧啶醚(pyrimidifen)(706)+TX、嘧硫磷(1370)+TX、喹硫磷(quinalphos)(711)+TX、喹硫磷(quintiofos)(1381)+TX、R-1492(研究代码)(1382)+TX、RA-17(研究代码)(1383)+TX、鱼藤酮(722)+TX、八甲磷(schradan)(1389)+TX、克线丹(sebufos)(别名)+TX、司拉克丁(selamectin)(别名)[CCN]+TX、SI-0009(化合物代码)+TX、苏硫磷(sophamide)(1402)+TX、螺螨酯(738)+TX、螺甲螨酯(739)+TX、SSI-121(研究代码)(1404)+TX、舒非仑(别名)[CCN]+TX、氟虫胺(sulfluramid)(750)+TX、硫特普(sulfotep)(753)+TX、硫(754)+TX、SZI-121(研究代码)(757)+TX、 $\tau$ -氟胺氰菊酯(398)+TX、吡螨胺(763)+TX、TEPP(1417)+TX、叔丁威(terbam)(别名)+TX、司替罗磷(777)+TX、四氯杀螨砒(tetradifon)(786)+TX、杀螨素(tetranactin)(别名)(653)+TX、杀螨好(tetrasul)(1425)+TX、thiafenox(别名)+TX、抗虫威(thiocarboxime)(1431)+TX、久效威(thiofanox)(800)+TX、甲基乙拌磷(thiometon)(801)+TX、克杀螨(1436)+TX、苏力菌素(thuringiensin)(别名)[CCN]+TX、威菌磷(triamiphos)(1441)+TX、苯螨噻(triarathene)(1443)+TX、三唑磷(820)+TX、灭蚜啞(triazuron)(别名)+TX、敌百虫(824)+TX、三氯丙氧磷(trifenofos)(1455)+TX、三活菌素(trinactin)(别名)(653)+TX、蚜灭多(847)+TX、甲烯氟虫腈(vaniliprole)[CCN]和YI-5302(化合物代码)+TX,

[0667] 杀藻剂-所述杀藻剂选自由以下组成的物质组:百杀辛(bethoxazin)[CCN]+TX、二辛酸铜(IUPAC名称)(170)+TX、硫酸铜(172)+TX、cybutryne[CCN]+TX、二氯萘醌(dichlone)

(1052)+TX、双氯酚(232)+TX、茵多酸(295)+TX、三苯锡(fentin)(347)+TX、熟石灰[CCN]+TX、代森钠(nabam)(566)+TX、灭藻醌(quinoclamine)(714)+TX、醌苜胺(quinonamid)(1379)+TX、西玛津(730)+TX、三苯基乙酸锡(IUPAC名称)(347)和三苯基氢氧化锡(IUPAC名称)(347)+TX,

[0668] 驱蠕虫剂-所述驱蠕虫剂选自由以下组成的物质组:阿维菌素(1)+TX、育畜磷(1011)+TX、多拉克汀(别名)[CCN]+TX、埃玛菌素(291)+TX、埃玛菌素苯甲酸酯(291)+TX、依立诺克丁(别名)[CCN]+TX、伊维菌素(别名)[CCN]+TX、米尔贝肟(别名)[CCN]+TX、莫昔克丁(别名)[CCN]+TX、哌嗪[CCN]+TX、司拉克丁(selamectin)(别名)[CCN]+TX、多杀菌素(737)和托布津(thiophanate)(1435)+TX,

[0669] 杀鸟剂-所述杀鸟剂选自由以下组成的物质组:氯醛糖(127)+TX、异狄氏剂(1122)+TX、倍硫磷(346)+TX、吡啶-4-胺(IUPAC名称)(23)和土的宁(745)+TX,

[0670] 杀细菌剂-所述杀细菌剂选自由以下组成的物质组:1-羟基-1H-吡啶-2-硫酮(IUPAC名称)(1222)+TX、4-(喹啉啉-2-基氨基)苯磺酰胺(IUPAC名称)(748)+TX、8-羟基喹啉硫酸盐(446)+TX、溴硝醇(97)+TX、二辛酸铜(IUPAC名称)(170)+TX、氢氧化铜(IUPAC名称)(169)+TX、甲酚[CCN]+TX、双氯酚(232)+TX、双吡硫翁(1105)+TX、多地辛(1112)+TX、敌磺钠(fenaminosulf)(1144)+TX、甲醛(404)+TX、汞加芬(别名)[CCN]+TX、春雷霉素(483)+TX、春雷霉素盐酸盐水合物(483)+TX、二(二甲基二硫代氨基甲酸)镍(IUPAC名称)(1308)+TX、三氯甲基吡啶(nitrapyrin)(580)+TX、辛噻酮(octhilinone)(590)+TX、奥索利酸(606)+TX、土霉素(611)+TX、羟基喹啉硫酸钾(446)+TX、噻菌灵(probenazole)(658)+TX、链霉素(744)+TX、链霉素倍半硫酸盐(744)+TX、叶枯酞(766)+TX、和硫柳汞(别名)[CCN]+TX,

[0671] 生物试剂-所述生物试剂选自由以下组成的物质组:棉褐带卷蛾GV(别名)(12)+TX、放射形土壤杆菌(别名)(13)+TX、钝绥螨属物种(*Amblyseius* spp.)(别名)(19)+TX、芹菜夜蛾NPV(别名)(28)+TX、原樱翅缨小蜂(*Anagrus atomus*)(别名)(29)+TX、短距蚜小蜂(*Aphelinus abdominalis*)(别名)(33)+TX、棉蚜寄生蜂(*Aphidius colemani*)(别名)(34)+TX、食蚜瘦蚊(*Aphidoletes aphidimyza*)(别名)(35)+TX、苜蓿银纹夜蛾NPV(别名)(38)+TX、坚强芽孢杆菌(*Bacillus firmus*)(别名)(48)+TX、球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus* Neide)(学名)(49)+TX、苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis* Berliner)(学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌鮎泽亚种(*Bacillus thuringiensis* subsp.aizawai)(学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌以色列亚种(*Bacillus thuringiensis* subsp.israelensis)(学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌日本亚种(*Bacillus thuringiensis* subsp.japonensis)(学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(*Bacillus thuringiensis* subsp.kurstaki)(学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种(*Bacillus thuringiensis* subsp.tenebrionis)(学名)(51)+TX、球孢白僵菌(*Beauveria bassiana*)(别名)(53)+TX、布氏白僵菌(*Beauveria brongniartii*)(别名)(54)+TX、普通草蛉(*Chrysoperla carnea*)(别名)(151)+TX、孟氏隐唇瓢虫(*Cryptolaemus montrouzieri*)(别名)(178)+TX、苹果蠹蛾GV(别名)(191)+TX、西伯利亚离颚茧蜂(*Dacnusa sibirica*)(别名)(212)+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂(*Diglyphus isaea*)(别名)(254)+TX、丽蚜小蜂(*Encarsia formosa*)(学名)(293)+TX、桨角蚜小蜂(*Eretmocerus eremicus*)(别名)(300)+TX、谷实夜蛾NPV(别名)(431)+TX、嗜菌异小杆线虫(*Heterorhabditis bacteriophora*)和大异小杆线



虫(*H.megidis*) (别名) (433)+TX、斑长足瓢虫(*Hippodamia convergens*) (别名) (442)+TX、橘粉介壳虫寄生蜂(*Leptomastix dactylopii*) (别名) (488)+TX、盲蝽(*Macrolophus caliginosus*) (别名) (491)+TX、甘蓝夜蛾NPV(别名) (494)+TX、黄阔柄跳小蜂(*Metaphycus helvolus*) (别名) (522)+TX、黄绿绿僵菌(*Metarhizium anisopliae* var.*acridum*) (学名) (523)+TX、金龟子绿僵菌小孢变种(*Metarhizium anisopliae* var.*anisopliae*) (学名) (523)+TX、欧洲新松叶蜂(*Neodiprion sertifer*) NPV和红头新松叶蜂(*N.lecontei*) NPV(别名) (575)+TX、小花蝽属物种(别名) (596)+TX、玫烟色拟青霉(*Paecilomyces fumosoroseus*) (别名) (613)+TX、智利小植绥螨(*Phytoseiulus persimilis*) (别名) (644)+TX、甜菜夜蛾核多角体病毒(*Spodoptera exigua* multicapsid nuclear polyhedrosis virus) (学名) (741)+TX、毛蚊线虫(*Steinernema bibionis*) (别名) (742)+TX、小卷蛾斯氏线虫(*Steinernema carpocapsae*) (别名) (742)+TX、夜蛾斯氏线虫(别名) (742)+TX、格氏线虫(*Steinernema glaseri*) (别名) (742)+TX、锐比斯氏线虫(*Steinernema riobrave*) (别名) (742)+TX、*Steinernema riobravis* (别名) (742)+TX、蝼蛄斯氏线虫(*Steinernema scapterisci*) (别名) (742)+TX、斯氏线虫属物种(*Steinernema* spp.) (别名) (742)+TX、赤眼蜂属物种(别名) (826)+TX、西方盲走螨(*Typhlodromus occidentalis*) (别名) (844)和蜡蚧轮枝菌(*Verticillium lecanii*) (别名) (848)+TX,

[0672] 土壤消毒剂-所述土壤消毒剂选自由以下组成的物质组:碘甲烷(IUPAC名称) (542)和溴甲烷(537)+TX,

[0673] 化学不育剂-所述化学不育剂选自由以下组成的物质组:啞磷嗪(apholate) [CCN]+TX、双(氮丙啶)甲氨基磷硫化物(bisazir) (别名) [CCN]+TX、白消安(别名) [CCN]+TX、除虫脲(250)+TX、迪麦替夫(dimatif) (别名) [CCN]+TX、六甲蜜胺(hemel) [CCN]+TX、六甲磷(hempa) [CCN]+TX、甲基涕巴(metepa) [CCN]+TX、甲硫涕巴(methiotepa) [CCN]+TX、甲基啞磷嗪(methyl apholate) [CCN]+TX、不孕啞(morzid) [CCN]+TX、氟幼脲(penfluron) (别名) [CCN]+TX、涕巴(tepa) [CCN]+TX、硫代六甲磷(thiohempa) (别名) [CCN]+TX、硫涕巴(别名) [CCN]+TX、曲他胺(别名) [CCN]和尿烷亚胺(别名) [CCN]+TX,

[0674] 昆虫信息素-所述昆虫信息素选自由以下组成的物质组:(E)-癸-5-烯-1-基乙酸酯与(E)-癸-5-烯-1-醇(IUPAC名称) (222)+TX、(E)-十三碳-4-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (829)+TX、(E)-6-甲基庚-2-烯-4-醇(IUPAC名称) (541)+TX、(E,Z)-十四碳-4,10-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (779)+TX、(Z)-十二碳-7-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (285)+TX、(Z)-十六碳-11-烯醛(IUPAC名称) (436)+TX、(Z)-十六碳-11-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (437)+TX、(Z)-十六碳-13-烯-11-炔-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (438)+TX、(Z)-二十-13-烯-10-酮(IUPAC名称) (448)+TX、(Z)-十四碳-7-烯-1-醛(IUPAC名称) (782)+TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-醇(IUPAC名称) (783)+TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (784)+TX、(7E,9Z)-十二碳-7,9-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (283)+TX、(9Z,11E)-十四碳-9,11-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (780)+TX、(9Z,12E)-十四碳-9,12-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (781)+TX、14-甲基十八碳-1-烯(IUPAC名称) (545)+TX、4-甲基壬-5-醇与4-甲基壬-5-酮(IUPAC名称) (544)+TX、 $\alpha$ -多纹素(alpha-multistriatin) (别名) [CCN]+TX、西部松小蠹集合信息素(brevicommin) (别名) [CCN]+TX、十二碳二烯醇(codlure) (别名) [CCN]+TX、可得蒙(codlemone) (别名) (167)+TX、诱蝇酮(cuelure) (别名) (179)+TX、环氧十九烷

(disparlure) (277)+TX、十二碳-8-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (286)+TX、十二碳-9-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (287)+TX、十二碳-8+TX、10-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (284)+TX、dominicalure (别名) [CCN]+TX、4-甲基辛酸乙酯(IUPAC名称) (317)+TX、丁香酚(别名) [CCN]+TX、南部松小蠹集合信息素(frontalin) (别名) [CCN]+TX、诱虫十六酯(gossyplure) (别名) (420)+TX、诱杀烯混剂(grandlure) (421)+TX、诱杀烯混剂I(别名) (421)+TX、诱杀烯混剂II(别名) (421)+TX、诱杀烯混剂III(别名) (421)+TX、诱杀烯混剂IV(别名) (421)+TX、己诱剂(hexalure) [CCN]+TX、齿小蠹二烯醇(ipsdienol) (别名) [CCN]+TX、小蠹烯醇(ipsenol) (别名) [CCN]+TX、金龟子性诱剂(japonilure) (别名) (481)+TX、三甲基二氧三环壬烷(lineatin) (别名) [CCN]+TX、litlure (别名) [CCN]+TX、粉纹夜蛾性诱剂(looplure) (别名) [CCN]+TX、诱杀酯(medlure) [CCN]+TX、megatomoic acid (别名) [CCN]+TX、诱虫醚(methyl eugenol) (别名) (540)+TX、诱虫烯(muscalure) (563)+TX、十八碳-2,13-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (588)+TX、十八碳-3,13-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (589)+TX、贺康彼(orfralure) (别名) [CCN]+TX、椰蛀犀金龟聚集信息素(oryctalure) (别名) (317)+TX、非乐康(ostramone) (别名) [CCN]+TX、诱虫环(siglure) [CCN]+TX、sordidin(别名) (736)+TX、食菌甲诱醇(sulcatol) (别名) [CCN]+TX、十四碳-11-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称) (785)+TX、地中海实蝇引诱剂(839)+TX、地中海实蝇引诱剂A(别名) (839)+TX、地中海实蝇引诱剂B<sub>1</sub>(别名) (839)+TX、地中海实蝇引诱剂B<sub>2</sub>(别名) (839)+TX、地中海实蝇引诱剂C(别名) (839)和trunc-call(别名) [CCN]+TX,

[0675] 昆虫驱避剂-所述昆虫驱避剂选自由以下组成的物质组:2-(辛基硫代)乙醇(IUPAC名称) (591)+TX、避蚊酮(butopyronoxyl) (933)+TX、丁氧基(聚丙二醇) (936)+TX、己二酸二丁酯(IUPAC名称) (1046)+TX、邻苯二甲酸二丁酯(1047)+TX、丁二酸二丁酯(IUPAC名称) (1048)+TX、避蚊胺[CCN]+TX、驱蚊灵(dimethyl carbate) [CCN]+TX、邻苯二甲酸二甲酯[CCN]+TX、乙基己二醇(1137)+TX、己脲[CCN]+TX、甲喹丁(methoquin-butyl) (1276)+TX、甲基新癸酰胺[CCN]+TX、草氨酸盐(oxamate) [CCN]和派卡瑞丁[CCN]+TX,

[0676] 杀昆虫剂-所述杀昆虫剂选自由以下组成的物质组:1-二氯-1-硝基乙烷(IUPAC/化学文摘名称) (1058)+TX、1,1-二氯-2,2-二(4-乙基苯基)乙烷(IUPAC名称) (1056)+TX、1,2-二氯丙烷(IUPAC/化学文摘名称) (1062)+TX、带有1,3-二氯丙烯的1,2-二氯丙烷(IUPAC名称) (1063)+TX、1-溴-2-氯乙烷(IUPAC/化学文摘名称) (916)+TX、乙酸2,2,2-三氯-1-(3,4-二氯苯基)乙基酯(IUPAC名称) (1451)+TX、2,2-二氯乙烯基2-乙基亚磺酰基乙基甲基磷酸酯(IUPAC名称) (1066)+TX、二甲基氨基甲酸2-(1,3-二硫杂环戊烷-2-基)苯基酯(IUPAC/化学文摘名称) (1109)+TX、硫氰酸2-(2-丁氧基乙氧基)乙基酯(IUPAC/化学文摘名称) (935)+TX、甲基氨基甲酸2-(4,5-二甲基-1,3-二氧环戊烷-2-基)苯基酯(IUPAC/化学文摘名称) (1084)+TX、2-(4-氯-3,5-二甲苯基氧基)乙醇(IUPAC名称) (986)+TX、2-氯乙烯基二乙基磷酸酯(IUPAC名称) (984)+TX、2-咪唑啉酮(IUPAC名称) (1225)+TX、2-异戊酰基茛满-1,3-二酮(IUPAC名称) (1246)+TX、甲基氨基甲酸2-甲基(丙-2-炔基)氨基苯基酯(IUPAC名称) (1284)+TX、月桂酸2-硫氰基乙基酯(IUPAC名称) (1433)+TX、3-溴-1-氯丙-1-烯(IUPAC名称) (917)+TX、二甲基氨基甲酸3-甲基-1-苯基吡唑-5-基酯(IUPAC名称) (1283)+TX、甲基氨基甲酸4-甲基(丙-2-炔基)氨基-3,5-二甲苯基酯(IUPAC名称) (1285)+TX、二甲基氨基甲酸5,5-二甲基-3-氧代环己-1-烯基酯(IUPAC名称) (1085)+TX、阿维菌素(1)+TX、乙酰甲胺

磷(2)+TX、啉虫脒(4)+TX、家蝇磷(别名)[CCN]+TX、乙酰虫脒[CCN]+TX、氟丙菊酯(9)+TX、丙烯腈(IUPAC名称)(861)+TX、棉铃威(15)+TX、涕灭威(16)+TX、涕灭砒威(863)+TX、氯甲桥萘(864)+TX、烯丙菊酯(17)+TX、阿洛氨菌素(别名)[CCN]+TX、除害威(866)+TX、 $\alpha$ -氯氰菊酯(202)+TX、 $\alpha$ -蜕皮激素(别名)[CCN]+TX、磷化铝(640)+TX、赛硫磷(870)+TX、硫代酰胺(872)+TX、灭害威(873)+TX、胺吸磷(875)+TX、胺吸磷草酸氢盐(875)+TX、双甲脒(24)+TX、新烟碱(877)+TX、乙基杀扑磷(883)+TX、AVI 382(化合物代码)+TX、AZ 60541(化合物代码)+TX、印楝素(别名)(41)+TX、甲基吡啶磷(42)+TX、谷硫磷-乙基(44)+TX、谷硫磷-甲基(45)+TX、偶氮磷(889)+TX、苏云金芽孢杆菌 $\delta$ 内毒素类(别名)(52)+TX、六氟硅酸钡(别名)[CCN]+TX、多硫化钡(IUPAC/化学文摘名称)(892)+TX、熏菊酯[CCN]+TX、Bayer 22/190(研究代码)(893)+TX、Bayer22408(研究代码)(894)+TX、噁虫威(58)+TX、丙硫克百威(60)+TX、杀虫磺(66)+TX、 $\beta$ -氟氯氰菊酯(194)+TX、 $\beta$ -氯氰菊酯(203)+TX、联苯菊酯(76)+TX、生物烯丙菊酯(78)+TX、生物烯丙菊酯S-环戊烯基异构体(别名)(79)+TX、戊环苄呋菊酯(bioethanomethrin)[CCN]+TX、生物氯菊酯(908)+TX、除虫菊酯(80)+TX、二(2-氯乙基)醚(IUPAC名称)(909)+TX、双三氟虫脒(83)+TX、硼砂(86)+TX、溴灭菊酯(别名)+TX、溴苯烯磷(914)+TX、溴杀烯(918)+TX、溴-DDT(别名)[CCN]+TX、溴硫磷(920)+TX、溴硫磷-乙基(921)+TX、合杀威(924)+TX、噻嗪酮(99)+TX、畜虫威(926)+TX、脱甲基丁噻啶磷(butathiofos)(927)+TX、丁酮威(103)+TX、丁酯磷(932)+TX、丁酮砒威(104)+TX、丁基哒螨灵(别名)+TX、硫线磷(109)+TX、砷酸钙[CCN]+TX、氰化钙(444)+TX、多硫化钙(IUPAC名称)(111)+TX、毒杀芬(941)+TX、氯灭杀威(943)+TX、甲萘威(115)+TX、克百威(118)+TX、二硫化碳(IUPAC/化学文摘名称)(945)+TX、四氯化碳(IUPAC名称)(946)+TX、三硫磷(947)+TX、丁硫克百威(119)+TX、杀螟丹(123)+TX、杀螟丹盐酸盐(123)+TX、西伐丁(别名)(725)+TX、冰片丹(960)+TX、氯丹(128)+TX、开蓬(963)+TX、杀虫脒(964)+TX、杀虫脒盐酸盐(964)+TX、氯氧磷(129)+TX、溴虫脒(130)+TX、毒虫畏(131)+TX、定虫隆(132)+TX、氯甲磷(136)+TX、氯仿[CCN]+TX、三氯硝基甲烷(141)+TX、氯辛硫磷(989)+TX、灭虫吡啶(990)+TX、毒死蜱(145)+TX、毒死蜱-甲基(146)+TX、虫螨磷(994)+TX、环虫酰肼(150)+TX、灰菊素I(696)+TX、灰菊素II(696)+TX、灰菊素类(696)+TX、顺式苄呋菊酯(cis-resmethrin)(别名)+TX、顺式苄呋菊酯(cismethrin)(80)+TX、功夫菊酯(别名)+TX、除线威(999)+TX、氯氰碘柳胺(别名)[CCN]+TX、噻虫胺(165)+TX、乙酰亚砷酸铜[CCN]+TX、砷酸铜[CCN]+TX、油酸铜[CCN]+TX、蝇毒磷(174)+TX、畜虫磷(1006)+TX、克罗米通(别名)[CCN]+TX、巴毒磷(1010)+TX、克芦磷酯(1011)+TX、冰晶石(别名)(177)+TX、CS 708(研究代码)(1012)+TX、苯腈磷(1019)+TX、杀螟睛(184)+TX、果虫磷(1020)+TX、环虫菊酯[CCN]+TX、乙氰菊酯(188)+TX、氟氯氰菊酯(193)+TX、三氯氟氰菊酯(196)+TX、氯氰菊酯(201)+TX、苯氰菊酯(206)+TX、环丙马秦(209)+TX、畜蜚磷(别名)[CCN]+TX、d-柠檬烯(别名)[CCN]+TX、d-四甲菊酯(别名)(788)+TX、DAEP(1031)+TX、棉隆(216)+TX、DDT(219)+TX、单甲基克百威(decarbofuran)(1034)+TX、溴氰菊酯(223)+TX、田乐磷(1037)+TX、田乐磷-0(1037)+TX、田乐磷-S(1037)+TX、内吸磷(1038)+TX、内吸磷-甲基(224)+TX、内吸磷-0(1038)+TX、内吸磷-0-甲基(224)+TX、内吸磷-S(1038)+TX、内吸磷-S-甲基(224)+TX、内吸磷-S-甲基砒(1039)+TX、丁醚脒(226)+TX、氯亚胺硫磷(1042)+TX、二胺磷(1044)+TX、二嗪磷(227)+TX、异氯磷(1050)+TX、除线磷(1051)+TX、敌敌畏(236)+TX、迪克力弗斯(dicliphos)(别名)+TX、迪克莱赛尔(dicresyl)(别名)[CCN]+TX、百治磷(243)+TX、地昔尼

尔(244)+TX、狄氏刑(1070)+TX、二乙基5-甲基吡唑-3-基磷酸酯(IUPAC名称)(1076)+TX、除虫脲(250)+TX、二羟丙茶碱(dilor)(别名)[CCN]+TX、四氟甲醚菊酯[CCN]+TX、甲氟磷(1081)+TX、地麦威(1085)+TX、乐果(262)+TX、苜菊酯(1083)+TX、甲基毒虫畏(265)+TX、敌蝇威(1086)+TX、消螨酚(1089)+TX、消螨酚(dinex-diclexine)(1089)+TX、丙硝酚(1093)+TX、戊硝酚(1094)+TX、达诺杀(1095)+TX、呋虫胺(271)+TX、苯虫醚(1099)+TX、蔬果磷(1100)+TX、二氧威(1101)+TX、敌恶磷(1102)+TX、乙拌磷(278)+TX、苯噻乙双硫磷(dithicrofos)(1108)+TX、DNOC(282)+TX、多拉克汀(别名)[CCN]+TX、DSP(1115)+TX、蜕皮激素(别名)[CCN]+TX、EI 1642(研究代码)(1118)+TX、依马克丁(291)+TX、依马克丁苯甲酸酯(291)+TX、EMPC(1120)+TX、烯炔菊酯(292)+TX、硫丹(294)+TX、因毒磷(1121)+TX、异狄氏剂(1122)+TX、EPBP(1123)+TX、EPN(297)+TX、保幼醚(1124)+TX、依立诺克丁(别名)[CCN]+TX、高氰戊菊酯(302)+TX、牛津郡丙硫磷(etaphos)(别名)[CCN]+TX、乙硫苯威(308)+TX、乙硫磷(309)+TX、乙虫腈(310)+TX、益硫磷(1134)+TX、灭线磷(312)+TX、甲酸乙酯(IUPAC名称)[CCN]+TX、乙基-DDD(别名)(1056)+TX、二溴乙烷(316)+TX、二氯乙烷(化学名称)(1136)+TX、环氧乙烷[CCN]+TX、醚菊酯(319)+TX、乙嘧硫磷(1142)+TX、EXD(1143)+TX、伐灭磷(323)+TX、苯线磷(326)+TX、抗螨唑(1147)+TX、皮蝇磷(1148)+TX、乙苯威(1149)+TX、五氟苯菊酯(1150)+TX、杀螟硫磷(335)+TX、仲丁威(336)+TX、氧嘧酰胺(fenoxacrim)(1153)+TX、苯氧威(340)+TX、吡氯氰菊酯(1155)+TX、甲氰菊酯(342)+TX、fenpyrad(别名)+TX、丰索磷(1158)+TX、倍硫磷(346)+TX、乙基倍硫磷[CCN]+TX、氰戊菊酯(349)+TX、氟虫腈(354)+TX、氟啶虫酰胺(358)+TX、氟虫双酰胺(CAS登记号:272451-65-7)+TX、氟氯双苯隆(flucofuron)(1168)+TX、氟环脲(366)+TX、氟氰戊菊酯(367)+TX、联氟螨(1169)+TX、噻虫胺[CCN]+TX、氟虫脲(370)+TX、三氟醚菊酯(1171)+TX、氟氯苯菊酯(372)+TX、氟胺氰菊酯(1184)+TX、FMC 1137(研究代码)(1185)+TX、地虫磷(1191)+TX、伐虫脒(405)+TX、伐虫脒盐酸盐(405)+TX、安硫磷(1192)+TX、藻螨威(formparanate)(1193)+TX、丁苯硫磷(1194)+TX、福司吡酯(1195)+TX、噻唑酮磷(408)+TX、丁硫环磷(1196)+TX、呋线威(412)+TX、抗虫菊(1200)+TX、 $\gamma$ -氯氟氰菊酯(197)+TX、 $\gamma$ -HCH(430)+TX、双胍盐(422)+TX、双胍醋酸盐(422)+TX、GY-81(研究代码)(423)+TX、苜螨醚(424)+TX、氯虫酰胺(425)+TX、HCH(430)+TX、HEOD(1070)+TX、飞布达(1211)+TX、庚烯磷(432)+TX、速杀硫磷[CCN]+TX、氟铃脲(439)+TX、HHDN(864)+TX、氟蚁腠(443)+TX、氢氰酸(444)+TX、烯虫乙酯(445)+TX、海驱威(hyquincarb)(1223)+TX、吡虫啉(458)+TX、炔咪菊酯(460)+TX、茚虫威(465)+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、IPSP(1229)+TX、氯唑磷(1231)+TX、碳氯灵(1232)+TX、水胺硫磷(别名)(473)+TX、异艾氏剂(1235)+TX、异柳磷(1236)+TX、移栽灵(1237)+TX、异丙威(472)+TX、O-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸异丙酯(IUPAC名称)(473)+TX、稻瘟灵(474)+TX、异拌磷(1244)+TX、恶唑磷(480)+TX、伊维菌素(别名)[CCN]+TX、茚酮菊素I(696)+TX、茚酮菊素II(696)+TX、碘硫磷(1248)+TX、保幼激素I(别名)[CCN]+TX、保幼激素II(别名)[CCN]+TX、保幼激素III(别名)[CCN]+TX、氯戊环(1249)+TX、烯虫炔酯(484)+TX、 $\lambda$ -氯氟氰菊酯(198)+TX、砷酸铅[CCN]+TX、雷皮菌素(CCN)+TX、对溴磷(1250)+TX、林旦(430)+TX、丙嘧硫磷(lirimfos)(1251)+TX、虱螨脲(490)+TX、噻唑磷(1253)+TX、间异丙基苯基甲基氨基甲酸酯(IUPAC名称)(1014)+TX、磷化镁(IUPAC名称)(640)+TX、马拉硫磷(492)+TX、特螨腈(1254)+TX、叠氮磷(1255)+TX、灭蚜磷(502)+TX、四甲磷(1258)+TX、灭蚜硫磷(1260)+TX、地安磷(1261)+TX、

氯化亚汞 (513)+TX、倍硫磷亚砷 (mesulfenfos) (1263)+TX、氰氟虫腴 (CCN)+TX、威百亩 (519)+TX、威百亩钾 (别名) (519)+TX、威百亩钠 (519)+TX、虫螨畏 (1266)+TX、甲胺磷 (527)+TX、甲烷磺酰氟 (IUPAC/化学文摘名称) (1268)+TX、杀扑磷 (529)+TX、灭虫威 (530)+TX、杀虫乙烯磷 (1273)+TX、灭多威 (531)+TX、烯虫酯 (532)+TX、甲啶丁 (1276)+TX、甲醚菊酯 (别名) (533)+TX、甲氧滴滴涕 (534)+TX、甲氧苯酰 (535)+TX、溴甲烷 (537)+TX、异硫氰酸甲酯 (543)+TX、甲基氯仿 (别名) [CCN]+TX、二氯甲烷 [CCN]+TX、甲氧苄氟菊酯 [CCN]+TX、速灭威 (550)+TX、恶虫酮 (1288)+TX、速灭磷 (556)+TX、兹克威 (1290)+TX、密灭汀 (557)+TX、米尔倍霉素 (别名) [CCN]+TX、丙胺氟磷 (1293)+TX、灭蚁灵 (1294)+TX、久效磷 (561)+TX、茂硫磷 (1300)+TX、莫昔克丁 (别名) [CCN]+TX、萘酞磷 (别名) [CCN]+TX、二溴磷 (567)+TX、萘 (IUPAC/化学文摘名称) (1303)+TX、NC-170 (研究代码) (1306)+TX、NC-184 (化合物代码)+TX、烟碱 (578)+TX、硫酸烟碱 (578)+TX、氟蚁灵 (1309)+TX、烯啶虫胺 (579)+TX、硝乙脲噻唑 (nithiazine) (1311)+TX、戊氰威 (1313)+TX、戊氰威1:1氯化锌络合物 (1313)+TX、NNI-0101 (化合物代码)+TX、NNI-0250 (化合物代码)+TX、降烟碱 (传统名称) (1319)+TX、双苯氟脲 (585)+TX、多氟脲 (586)+TX、0-5-二氯-4-碘苯基0-乙基乙基硫代膦酸酯 (IUPAC名称) (1057)+TX、0,0-二乙基0-4-甲基-2-氧代-2H-色烯-7-基硫代膦酸酯 (IUPAC名称) (1074)+TX、0,0-二乙基0-6-甲基-2-丙基嘧啶-4-基硫代膦酸酯 (IUPAC名称) (1075)+TX、0,0,0',0'-四丙基二硫代焦磷酸酯 (IUPAC名称) (1424)+TX、油酸 (IUPAC名称) (593)+TX、氧化乐果 (594)+TX、杀线威 (602)+TX、砷吸磷-甲基 (609)+TX、异亚砷磷 (1324)+TX、砷拌磷 (1325)+TX、pp'-DDT (219)+TX、对-二氯苯 [CCN]+TX、对硫磷 (615)+TX、对硫磷-甲基 (616)+TX、氟幼脲 (别名) [CCN]+TX、五氯苯酚 (623)+TX、月桂酸五氯苯基酯 (IUPAC名称) (623)+TX、氯菊酯 (626)+TX、石油油料 (别名) (628)+TX、PH 60-38 (研究代码) (1328)+TX、芬硫磷 (1330)+TX、苯醚菊酯 (630)+TX、稻丰散 (631)+TX、甲拌磷 (636)+TX、伏杀硫磷 (637)+TX、硫环磷 (1338)+TX、亚胺硫磷 (638)+TX、对氯硫磷 (1339)+TX、磷胺 (639)+TX、磷化氢 (IUPAC名称) (640)+TX、辛硫磷 (642)+TX、辛硫磷-甲基 (1340)+TX、甲胺嘧磷 (pirimetaphos) (1344)+TX、抗蚜威 (651)+TX、乙基嘧啶磷 (1345)+TX、甲基嘧啶磷 (652)+TX、聚氯二环戊二烯异构体类 (IUPAC名称) (1346)+TX、氯化松节油 (polychloroterpenes) (传统名称) (1347)+TX、亚砷酸钾 [CCN]+TX、硫氰酸钾 [CCN]+TX、丙炔菊酯 (655)+TX、早熟素I (别名) [CCN]+TX、早熟素II (别名) [CCN]+TX、早熟素III (别名) [CCN]+TX、乙酰嘧啶磷 (primidophos) (1349)+TX、丙溴磷 (662)+TX、丙氟菊酯 [CCN]+TX、蜚虱威 (1354)+TX、猛杀威 (1355)+TX、丙虫磷 (1356)+TX、胺丙畏 (673)+TX、残杀威 (678)+TX、乙噻唑磷 (1360)+TX、丙硫磷 (686)+TX、发硫磷 (1362)+TX、丙苯炔菊酯 (protrifenbute) [CCN]+TX、吡蚜酮 (688)+TX、吡啶硫磷 (689)+TX、定菌磷 (693)+TX、苜呋菊酯 (pyresmethrin) (1367)+TX、除虫菊酯I (696)+TX、除虫菊酯II (696)+TX、除虫菊酯类 (696)+TX、哒螨灵 (699)+TX、啶虫丙醚 (700)+TX、哒嗪硫磷 (701)+TX、嘧螨醚 (706)+TX、嘧硫磷 (1370)+TX、吡丙醚 (708)+TX、苦木提取物 (quassia) (别名) [CCN]+TX、喹硫磷 (quinalphos) (711)+TX、喹硫磷-甲基 (1376)+TX、畜宁磷 (1380)+TX、喹硫磷 (quintiofos) (1381)+TX、R-1492 (研究代码) (1382)+TX、雷复尼特 (别名) [CCN]+TX、苜呋菊酯 (719)+TX、鱼藤酮 (722)+TX、RU 15525 (研究代码) (723)+TX、RU 25475 (研究代码) (1386)+TX、尼亚那 (ryania) (别名) (1387)+TX、利阿诺定 (传统名称) (1387)+TX、沙巴藜芦 (别名) (725)+TX、八甲磷 (1389)+TX、硫线磷 (别名)+TX、塞拉菌素 (别名) [CCN]+TX、SI-0009 (化合物代码)+TX、SI-0205 (化合

物代码)+TX、SI-0404(化合物代码)+TX、SI-0405(化合物代码)+TX、氟硅菊酯(728)+TX、SN 72129(研究代码)(1397)+TX、亚砷酸钠[CCN]+TX、氰化钠(444)+TX、氟化钠(IUPAC/化学文摘名称)(1399)+TX、六氟硅酸钠(1400)+TX、五氯酚钠(623)+TX、硒酸钠(IUPAC名称)(1401)+TX、硫氰酸钠[CCN]+TX、苏硫磷(1402)+TX、多杀菌素(737)+TX、螺甲螨酯(739)+TX、螺虫乙酯(CCN)+TX、萨尔科福隆(sulcofuron)(746)+TX、萨尔科福隆钠(sulcofuron-sodium)(746)+TX、氟虫胺(750)+TX、治螟磷(753)+TX、磺酰氟(756)+TX、硫丙磷(1408)+TX、焦油(别名)(758)+TX、 $\tau$ -氟胺氰菊酯(398)+TX、噻螨威(1412)+TX、TDE(1414)+TX、虫酰肼(762)+TX、吡螨胺(763)+TX、丁基嘧啶磷(764)+TX、氟苯脲(768)+TX、七氟菊酯(769)+TX、双硫磷(770)+TX、TEPP(1417)+TX、环戊烯丙菊酯(1418)+TX、叔丁威(terbam)(别名)+TX、特丁硫磷(773)+TX、四氯乙烷[CCN]+TX、杀虫畏(777)+TX、四甲菊酯(787)+TX、 $\theta$ 氯氰菊酯(204)+TX、噻虫啉(791)+TX、塞芬诺克斯(thiafenox)(别名)+TX、噻虫嗪(792)+TX、苯噻硫磷(thicrofos)(1428)+TX、克虫威(1431)+TX、杀虫环(798)+TX、杀虫环草酸氢盐(798)+TX、硫双威(799)+TX、久效威(800)+TX、甲基乙拌磷(801)+TX、虫线磷(1434)+TX、杀虫单(thiosultap)(803)+TX、杀虫双(thiosultap-sodium)(803)+TX、苏云金素(别名)[CCN]+TX、啮虫酰胺(809)+TX、四溴菊酯(812)+TX、四氟苯菊酯(813)+TX、反式苄氯菊酯(transpermethrin)(1440)+TX、威菌磷(1441)+TX、啮蚜威(818)+TX、三唑磷(820)+TX、啮呀威(别名)+TX、敌百虫(824)+TX、三氯偏磷酸-3(trichlormetaphos-3)(别名)[CCN]+TX、毒壤磷(1452)+TX、三氯丙氧磷(1455)+TX、杀铃脲(835)+TX、混杀威(840)+TX、烯虫硫酯(1459)+TX、蚜灭磷(847)+TX、甲烯氟虫脞(vaniliprole)[CCN]+TX、藜芦定(别名)(725)+TX、藜芦碱(别名)(725)+TX、XMC(853)+TX、灭杀威(854)+TX、YI-5302(化合物代码)+TX、 $\zeta$ -氯氰菊酯(205)+TX、泽塔米林(zetamethrin)(别名)+TX、磷化锌(640)+TX、丙硫恶唑磷(zolaprofos)(1469)以及ZXI 8901(研究代码)(858)+TX、氟虫酰胺[736994-63-19]+TX、氯虫酰胺[500008-45-7]+TX、啮螨氰(cyenopyrafen)[560121-52-0]+TX、丁氟螨酯[400882-07-7]+TX、氟虫吡啶(pyrifluquinazon)[337458-27-2]+TX、乙基多杀菌素(spinetoram)[187166-40-1+187166-15-0]+TX、螺虫乙酯[203313-25-1]+TX、砒虫啉(sulfoxafloz)[946578-00-3]+TX、丁虫脞(flufiprole)[704886-18-0]+TX、氯氟醚菊酯[915288-13-0]+TX、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)[84937-88-2]+TX、三氟苯嘧啶(triflumezopyrim)(披露于WO 2012/092115中)+TX、氟噁唑酰胺(fluxametamide)(WO 2007/026965)+TX、 $\epsilon$ -甲氧苄氟菊酯[240494-71-7]+TX、 $\epsilon$ -momfluorothrin[1065124-65-3]+TX、fluazaindolizine[1254304-22-7]+TX、氯碱丙炔菊酯[399572-87-3]+TX、fluxametamide[928783-29-3]+TX、氯氟氰虫酰胺(cyhalodiamide)[1262605-53-7]+TX、tiozazafen[330459-31-9]+TX、溴虫氟苯双酰胺(broflanilide)[1207727-04-5]+TX、丁烯氟虫脞(flufiprole)[704886-18-0]+TX、环溴虫酰胺[1031756-98-5]+TX、氟氰虫酰胺[1229654-66-3]+TX、戊吡虫脞(描述于WO 2010/060231中)+TX、环氧虫啉(描述于WO 2005/077934中)+TX、Spiropidion+TX、Afidopyropen+TX、flupyrimin+TX、Momfluorothrin+TX、 $\kappa$ -联苯菊酯+TX、 $\kappa$ -七氟菊酯+TX、Dichloromezotiaz+TX、Tetrachloraniliprole+TX、benzpyrimoxan+TX

[0677] 杀软体动物剂-所述杀软体动物剂选自由以下组成的物质组:二(三丁基锡)氧化物(IUPAC名称)(913)+TX、溴乙酰胺[CCN]+TX、砷酸钙[CCN]+TX、除线威(999)+TX、乙酰亚砷酸铜[CCN]+TX、硫酸铜(172)+TX、三苯锡(347)+TX、磷酸铁(IUPAC名称)(352)+TX、四聚乙醛

(518)+TX、灭虫威(530)+TX、氯硝柳胺(576)+TX、氯硝柳胺-乙醇胺(576)+TX、五氯酚(623)+TX、五氯苯氧化钠(623)+TX、噻螨威(tazimcarb)(1412)+TX、硫双威(799)+TX、三丁基氧化锡(913)+TX、蜗螺杀(trifenmorph)(1454)+TX、混杀威(trimethacarb)(840)+TX、三苯基乙酸锡(IUPAC名称)(347)和三苯基氢氧化锡(IUPAC名称)(347)+TX、吡啉虫啉(pyriprole)[394730-71-3]+TX,

[0678] 杀线虫剂-所述杀线虫剂选自由以下各项组成的物质组:AKD-3088(化合物代码)+TX、1,2-二溴-3-氯丙烷(IUPAC/化学文摘名称)(1045)+TX、1,2-二氯丙烷(IUPAC/化学文摘名称)(1062)+TX、1,2-二氯丙烷与1,3-二氯丙烯(IUPAC名称)(1063)+TX、1,3-二氯丙烯(233)+TX、3,4-二氯四氢噻吩1,1-二氧化物(IUPAC/化学文摘名称)(1065)+TX、3-(4-氯苯基)-5-甲基罗丹宁(IUPAC名称)(980)+TX、5-甲基-6-硫代-1,3,5-噻二嗪-3-基乙酸(IUPAC名称)(1286)+TX、6-异戊烯基氨基嘌呤(别名)(210)+TX、阿维菌素(1)+TX、乙酰虫腈[CCN]+TX、棉铃威(15)+TX、涕灭威(aldicarb)(16)+TX、涕灭砒威(863)+TX、AZ 60541(化合物代码)+TX、苯氯噻(benclothiaz)[CCN]+TX、苯菌灵(62)+TX、丁基吡啶灵(别名)+TX、克线丹(109)+TX、克百威(carbofuran)(118)+TX、二硫化碳(945)+TX、丁硫克百威(119)+TX、氯化苦(141)+TX、毒死蜱(145)+TX、除线威(999)+TX、细胞分裂素(别名)(210)+TX、棉隆(216)+TX、DBCP(1045)+TX、DCIP(218)+TX、除线特(diamidafos)(1044)+TX、除线磷(1051)+TX、二克磷(dicliphos)(别名)+TX、乐果(262)+TX、多拉克汀(别名)[CCN]+TX、埃玛菌素(291)+TX、埃玛菌素苯甲酸酯(291)+TX、依立诺克丁(别名)[CCN]+TX、灭线磷(312)+TX、二溴乙烷(316)+TX、苯线磷(326)+TX、fenpyrad(别名)+TX、丰索磷(1158)+TX、噻唑磷(408)+TX、丁硫环磷(1196)+TX、糠醛(别名)[CCN]+TX、GY-81(研究代码)(423)+TX、速杀硫磷[CCN]+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、异酰胺磷(isamidofos)(1230)+TX、氯唑磷(1231)+TX、伊维菌素(别名)[CCN]+TX、激动素(别名)(210)+TX、甲基减蚜磷(1258)+TX、威百亩(519)+TX、威百亩钾盐(别名)(519)+TX、威百亩钠盐(519)+TX、溴甲烷(537)+TX、异硫氰酸甲酯(543)+TX、米尔贝肟(别名)[CCN]+TX、莫昔克丁(别名)[CCN]+TX、疣孢漆斑菌(*Myrothecium verrucaria*)组合物(别名)(565)+TX、NC-184(化合物代码)+TX、杀线威(602)+TX、甲拌磷(636)+TX、磷胺(639)+TX、磷虫威[CCN]+TX、克线丹(别名)+TX、司拉克丁(别名)[CCN]+TX、多杀菌素(737)+TX、叔丁威(别名)+TX、特丁磷(773)+TX、四氯噻吩(IUPAC/化学文摘名称)(1422)+TX、thiafenox(别名)+TX、虫线磷(1434)+TX、三唑磷(820)+TX、唑蚜威(triazuron)(别名)+TX、二甲苯酚[CCN]+TX、YI-5302(化合物代码)和玉米素(别名)(210)+TX、氟噻虫砒(flusulfone)[318290-98-1]+TX、氟吡菌酰胺+TX,

[0679] 硝化抑制剂-所述硝化抑制剂选自由以下组成的物质组:乙基黄原酸钾[CCN]以及氯啉(nitrapyrin)(580)+TX,

[0680] 植物活化剂-所述植物活化剂选自由以下组成的物质组:阿拉酸式苯(acibenzolar)(6)+TX、阿拉酸式苯-S-甲基(6)+TX、噻菌灵(probenazole)(658)和大虎杖(*Reynoutria sachalinensis*)提取物(别名)(720)+TX,

[0681] 杀鼠剂-所述杀鼠剂选自由以下组成的物质组:2-异戊酰茛满-1,3-二酮(IUPAC名称)(1246)+TX、4-(喹啉啉-2-基氨基)苯磺酰胺(IUPAC名称)(748)+TX、 $\alpha$ -氯代醇[CCN]+TX、磷化铝(640)+TX、安妥(880)+TX、三氧化二砷(882)+TX、碳酸钡(891)+TX、双鼠脲(912)+TX、溴鼠隆(89)+TX、溴敌隆(91)+TX、溴鼠胺(92)+TX、氰化钙(444)+TX、氯醛糖(127)+TX、氯鼠

酮(140)+TX、胆钙化醇(别名)(850)+TX、氯灭鼠灵(1004)+TX、克灭鼠(1005)+TX、杀鼠萘(175)+TX、杀鼠啉(1009)+TX、鼠得克(246)+TX、噻鼠灵(249)+TX、敌鼠(273)+TX、钙化醇(301)+TX、氟鼠灵(357)+TX、氟乙酰胺(379)+TX、氟鼠啉(1183)+TX、氟鼠啉盐酸盐(1183)+TX、 $\gamma$ -HCH(430)+TX、HCH(430)+TX、氰化氢(444)+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、林旦(430)+TX、磷化镁(IUPAC名称)(640)+TX、溴甲烷(537)+TX、鼠特灵(1318)+TX、毒鼠磷(1336)+TX、磷化氢(IUPAC名称)(640)+TX、磷[CCN]+TX、杀鼠酮(1341)+TX、亚砷酸钾[CCN]+TX、灭鼠优(1371)+TX、海葱糖苷(1390)+TX、亚砷酸钠[CCN]+TX、氰化钠(444)+TX、氟乙酸钠(735)+TX、土的宁(745)+TX、硫酸铊[CCN]+TX、杀鼠灵(851)以及磷化锌(640)+TX,

[0682] 增效剂-所述增效剂选自由以下组成的物质组:2-(2-丁氧基乙氧基)乙基胡椒酯(IUPAC名称)(934)+TX、5-(1,3-苯并二氧杂环戊烯-5-基)-3-己基环己-2-烯酮(IUPAC名称)(903)+TX、具有橙花叔醇的法呢醇(别名)(324)+TX、MB-599(研究代码)(498)+TX、MGK 264(研究代码)(296)+TX、增效醚(piperonyl butoxide)(649)+TX、增效醛(piprotal)(1343)+TX、增效酯(propyl isomer)(1358)+TX、S421(研究代码)(724)+TX、增效散(sesamex)(1393)+TX、芝麻林素(sesasmolin)(1394)和亚砷(1406)+TX,动物驱避剂-所述动物驱避剂选自由以下组成的物质组:萹酮(32)+TX、氯醛糖(127)+TX、环烷酸铜[CCN]+TX、王铜(171)+TX、二嗪磷(227)+TX、二环戊二烯(化学名称)(1069)+TX、双胍辛盐(guazatine)(422)+TX、双胍辛乙酸盐(422)+TX、灭虫威(530)+TX、吡啶-4-胺(IUPAC名称)(23)+TX、塞仑(804)+TX、混杀威(trimethacarb)(840)+TX、环烷酸锌[CCN]和福美锌(856)+TX,

[0683] 杀病毒剂-所述杀病毒剂选自由以下组成的物质组:衣马宁(别名)[CCN]和利巴韦林(别名)[CCN]+TX,

[0684] 创伤保护剂-所述创伤保护剂选自由以下组成的物质组:氧化汞(512)+TX、辛噻酮(octhilinone)(590)和甲基托布津(802)+TX,

[0685] 以及生物活性化合物-所述生物活性化合物选自由以下组成的组:阿扎康唑(60207-31-0)+TX、联苯三唑醇[70585-36-3]+TX、糠菌唑[116255-48-2]+TX、环丙唑醇[94361-06-5]+TX、苯醚甲环唑[119446-68-3]+TX、烯唑醇[83657-24-3]+TX、氟环唑[106325-08-0]+TX、腈苯唑[114369-43-6]+TX、氟唑唑[136426-54-5]+TX、氟硅唑[85509-19-9]+TX、粉唑醇[76674-21-0]+TX、己唑醇[79983-71-4]+TX、抑霉唑[35554-44-0]+TX、亚胺唑[86598-92-7]+TX、种菌唑[125225-28-7]+TX、叶菌唑[125116-23-6]+TX、腈菌唑[88671-89-0]+TX、稻瘟酯[101903-30-4]+TX、戊菌唑[66246-88-6]+TX、丙硫菌唑[178928-70-6]+TX、啶斑肟(pyriifenox)[88283-41-4]+TX、咪鲜胺[67747-09-5]+TX、丙环唑[60207-90-1]+TX、硅氟唑(simeconazole)[149508-90-7]+TX、戊唑醇[107534-96-3]+TX、氟醚唑[112281-77-3]+TX、三唑酮[43121-43-3]+TX、三唑醇[55219-65-3]+TX、氟菌唑[99387-89-0]+TX、灭菌唑[131983-72-7]+TX、三环苯唑啉醇[12771-68-5]+TX、氯苯唑啉醇[60168-88-9]+TX、氟氯苯唑啉醇[63284-71-9]+TX、乙唑啉磺酸酯(bupirimate)[41483-43-6]+TX、甲菌定(dimethirimol)[5221-53-4]+TX、乙菌定(ethirimol)[23947-60-6]+TX、十二环吗啉[1593-77-7]+TX、苯锈啉(fenpropidine)[67306-00-7]+TX、丁苯吗啉[67564-91-4]+TX、螺环菌胺[118134-30-8]+TX、十三吗啉[81412-43-3]+TX、唑菌环胺[121552-61-2]+TX、唑菌胺[110235-47-7]+TX、唑霉胺(pyrimethanil)[53112-28-0]+TX、拌种咯[74738-17-3]+TX、咯菌腈(fludioxonil)[131341-86-1]+TX、苯霜灵(benalaxyl)[71626-11-4]+TX、咪霜灵



(furalaxyl) [57646-30-7]+TX、甲霜灵[57837-19-1]+TX、R-甲霜灵[70630-17-0]+TX、呋酰胺[58810-48-3]+TX、恶霜灵(Oxadixyl) [77732-09-3]+TX、苯菌灵[17804-35-2]+TX、多菌灵[10605-21-7]+TX、咪菌威(debacarb) [62732-91-6]+TX、麦穗宁[3878-19-1]+TX、噻苯达唑[148-79-8]+TX、乙菌利(chlozolinate) [84332-86-5]+TX、菌核利(dichlozoline) [24201-58-9]+TX、异菌脲(Iprodione) [36734-19-7]+TX、甲菌利(myclozoline) [54864-61-8]+TX、腐霉利(procymidone) [32809-16-8]+TX、乙烯菌核利(vinclozoline) [50471-44-8]+TX、啶酰菌胺(boscalid) [188425-85-6]+TX、萎锈灵[5234-68-4]+TX、甲呋酰胺[24691-80-3]+TX、福多宁(flutolanil) [66332-96-5]+TX、灭锈胺[55814-41-0]+TX、氧化萎锈灵[5259-88-1]+TX、吡噻菌胺(penthiopyrad) [183675-82-3]+TX、噻呋菌胺[130000-40-7]+TX、双胍盐[108173-90-6]+TX、多果定(dodine) [2439-10-3] [112-65-2] (游离碱)+TX、双胍辛胺(iminoctadine) [13516-27-3]+TX、嘧菌酯[131860-33-8]+TX、醚菌胺[149961-52-4]+TX、烯肟菌酯{Proc.BCPC, Int. Congr., Glasgow[格拉斯哥英国农作物保护委员会国际会议], 2003, 1, 93}+TX、氟嘧菌酯[361377-29-9]+TX、甲基醚菌酯[143390-89-0]+TX、苯氧菌胺[133408-50-1]+TX、肟菌酯[141517-21-7]+TX、肟醚菌胺[248593-16-0]+TX、啶氧菌酯[117428-22-5]+TX、唑菌胺酯[175013-18-0]+TX、福美铁[14484-64-1]+TX、代森锰锌[8018-01-7]+TX、代森锰[12427-38-2]+TX、代森联[9006-42-2]+TX、甲基代森锌(propineb) [12071-83-9]+TX、塞仑[137-26-8]+TX、代森锌[12122-67-7]+TX、福美锌[137-30-4]+TX、敌菌丹(captafol) [2425-06-1]+TX、克菌丹[133-06-2]+TX、抑菌灵[1085-98-9]+TX、唑呋草(fluoroimide) [41205-21-4]+TX、灭菌丹[133-07-3]+TX、对甲抑菌灵[731-27-1]+TX、波尔多混合剂[8011-63-0]+TX、氢氧化铜(copperhydroxid) [20427-59-2]+TX、氯化铜(copperoxychlorid) [1332-40-7]+TX、硫酸铜(coppersulfat) [7758-98-7]+TX、氧化铜(copperoxid) [1317-39-1]+TX、代森锰铜(mancopper) [53988-93-5]+TX、喹啉铜(oxine-copper) [10380-28-6]+TX、敌螨普(dinocap) [131-72-6]+TX、酞菌酯(nitrothal-isopropyl) [10552-74-6]+TX、克瘟散[17109-49-8]+TX、异稻瘟净(iprobenphos) [26087-47-8]+TX、稻瘟灵(isoprothiolane) [50512-35-1]+TX、氯瘟磷(phosdiphen) [36519-00-3]+TX、吡菌磷(pyrazophos) [13457-18-6]+TX、甲基立枯磷(tolclofos-methyl) [57018-04-9]+TX、阿拉酸式苯-S-甲基(acibenzolar-S-methyl) [135158-54-2]+TX、敌菌灵[101-05-3]+TX、苯噻菌胺[413615-35-7]+TX、灭瘟素(blasticidin) -S[2079-00-7]+TX、灭螨猛(chinomethionat) [2439-01-2]+TX、地茂散(chloroneb) [2675-77-6]+TX、百菌清[1897-45-6]+TX、环氟菌胺[180409-60-3]+TX、霜脲氰[57966-95-7]+TX、二氯萘醌(dichlone) [117-80-6]+TX、双氯氰菌胺(diclocymet) [139920-32-4]+TX、啞菌酮(diclomezine) [62865-36-5]+TX、氯硝胺(dicloran) [99-30-9]+TX、乙霉威(diethofencarb) [87130-20-9]+TX、烯酰吗啉[110488-70-5]+TX、SYP-LI90(氟吗啉(Flumorph)) [211867-47-9]+TX、二噻农(dithianon) [3347-22-6]+TX、噻唑菌胺(ethaboxam) [162650-77-3]+TX、土菌灵(etridiazole) [2593-15-9]+TX、恶唑菌酮[131807-57-3]+TX、咪唑菌酮(fenamidone) [161326-34-7]+TX、稻瘟酰胺(Fenoxanil) [115852-48-7]+TX、三苯锡(fentin) [668-34-8]+TX、嘧菌脲(ferimzone) [89269-64-7]+TX、氟啶胺(fluzinam) [79622-59-6]+TX、氟吡菌胺(flupicolide) [239110-15-7]+TX、磺菌胺(flusulfamide) [106917-52-6]+TX、环酰菌胺[126833-17-8]+TX、三乙膦酸铝(fosetyl-aluminium) [39148-24-8]+TX、恶霉灵

(hymexazol) [10004-44-1]+TX、丙森锌[140923-17-7]+TX、IKF-916(赛座灭(Cyazofamid)) [120116-88-3]+TX、春雷霉素(kasugamycin) [6980-18-3]+TX、磺菌威(methasulfocarb) [66952-49-6]+TX、苯菌酮[220899-03-6]+TX、戊菌隆(pencycuron) [66063-05-6]+TX、苯酞[27355-22-2]+TX、多氧霉素(polyoxins) [11113-80-7]+TX、噻菌灵(probenazole) [27605-76-1]+TX、霜霉威(propamocarb) [25606-41-1]+TX、碘啉唑酮(proquinazid) [189278-12-4]+TX、咯啉酮(pyroquilon) [57369-32-1]+TX、啉氧灵[124495-18-7]+TX、五氯硝基苯[82-68-8]+TX、硫[7704-34-9]+TX、噻酰菌胺[223580-51-6]+TX、咪唑嗪(triazoxide) [72459-58-6]+TX、三环唑[41814-78-2]+TX、啉氨灵[26644-46-2]+TX、有效霉素[37248-47-8]+TX、苯酰菌胺(zoxamide) (RH7281) [156052-68-5]+TX、双炔酰菌胺(mandipropamid) [374726-62-2]+TX、吡啉萘菌胺(isopyrazam) [881685-58-1]+TX、氟啉环菌胺(sedaxane) [874967-67-6]+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啉-4-羧酸(9-二氯亚甲基-1,2,3,4-四氢-1,4-桥亚甲基-萘-5-基)-酰胺(披露于WO 2007/048556中)+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啉-4-甲酸(3',4',5'-三氟-联苯-2-基)-酰胺(披露于WO 2006/087343中)+TX、[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[(环丙基羰基)氧基]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氢-6,12-二羟基-4,6a,12b-三甲基-11-氧代-9-(3-吡啶基)-2H,11H萘并[2,1-b]吡喃并[3,4-e]吡喃-4-基]甲基-环丙甲酸酯[915972-17-7]+TX以及1,3,5-三甲基-N-(2-甲基-1-氧丙基)-N-[3-(2-甲基丙基)-4-[2,2,2-三氟-1-甲氧基-1-(三氟甲基)乙基]苯基]-1H-吡啉-4-甲酰胺[926914-55-8]+TX;lancotrione[1486617-21-3]+TX;氯氟吡啶酯[943832-81-3]+TX;ipfentrifluconazole[1417782-08-1]+TX;氯氟醚菌唑(mefentrifluconazole) [1417782-03-6]+TX;quinofumelin[861647-84-9]+TX;右旋反式氯丙炔菊酯[399572-87-3]+TX;氯氟氰虫酰胺[1262605-53-7]+TX;三氟咪啶酰胺[1254304-22-7]+TX;fluxametamide[928783-29-3]+TX; $\epsilon$ -甲氧苄氟菊酯[240494-71-7]+TX; $\epsilon$ -momfluorothrin[1065124-65-3]+TX;氟啉菌酰羟胺(pydiflumetofen) [1228284-64-7]+TX; $\kappa$ -联苯菊酯[439680-76-9]+TX;溴虫苯双酰胺[1207727-04-5]+TX;dicloromezotiaz[1263629-39-5]+TX;dipymetitron[16114-35-5]+TX;pyraziflumid[942515-63-1]+TX; $\kappa$ -七氟菊酯[391634-71-2]+TX;fenpicoxamid[517875-34-2]+TX;氟茚唑菌胺(fluidapyr) [1383809-87-7]+TX;氟苯吡咯烷酮(flufenpyrrolidone)+TX、 $\alpha$ -溴敌隆[28772-56-7]+TX;flupyrimin[1689566-03-7]+TX;benzpyrimoxan[1449021-97-9]+TX;acynonapyr[1332838-17-1]+TX;inpyrfluxam[1352994-67-2]+TX, isoflucypram[1255734-28-1]+TX;isocycloseram+TX, rescalure[64309-03-1]+TX;aminopyrifin[1531626-08-0]+TX;tyclopypyrazoflor[1477919-27-9]+TX;和spiropidion[1229023-00-0]+TX;以及

[0686] 微生物剂,包括:鲁氏不动杆菌+TX、枝顶孢属真菌+TX+TX、顶头孢霉菌+TX+TX、Acremonium diospyri+TX、Acremonium obclavatum+TX、棉褐带卷蛾颗粒体病毒(AdoxGV) (**Capex®**)+TX、放射形土壤杆菌菌株K84 (Galltrol-**A®**)+TX、链格孢菌+TX、决明链格孢+TX、损毁链格孢(Alternaria destruens) (**Smolder®**)+TX、白粉寄生孢(**AQ10®**)+TX、黄曲霉AF36(**AF36®**)+TX、黄曲霉NRRL 21882(**Aflaguard®**)+TX、曲霉属物种+TX、出芽短梗霉菌+TX、固氮螺菌+TX、(**MicroAZ®**)+TX、TAZO **B®**)+TX、固氮菌+TX、褐球固

氮菌 (*Azotobacter chroococcum*) (**Azotomeal®**)+TX、固氮菌囊孢 (*Bionatural Blooming Blossoms®*)+TX、解淀粉芽孢杆菌+TX、蜡样芽孢杆菌+TX、蚀几丁质芽孢杆菌菌株 (*Bacillus chitinosporus strain*) CM-1+TX、蚀几丁质芽孢杆菌菌株 (*Bacillus chitinosporus strain*) AQ746+TX、地衣芽孢杆菌菌株 HB-2 (*Biostart™ Rhizoboost®*)+TX、地衣芽孢杆菌菌株 3086 (**EcoGuard®**+TX、**Green Releaf®**)+TX、环状芽孢杆菌+TX、坚强芽孢杆菌 (**BioSafe®**+TX、**BioNem-WP®**+TX、**VOTiVO®**)+TX、坚强芽孢杆菌菌株 I-1582+TX、浸麻芽孢杆菌+TX、死海芽孢杆菌 (*Bacillus marismortui*)+TX、巨大芽孢杆菌+TX、蕈状芽孢杆菌菌株 AQ726+TX、乳突芽孢杆菌 (*Milky Spore Powder®*)+TX、短小芽孢杆菌属物种+TX、短小芽孢杆菌菌株 GB34 (**YieldShield®**)+TX、短小芽孢杆菌菌株 AQ717+TX、短小芽孢杆菌菌株 QST 2808 (**Sonata®**+TX、**Ballad Plus®**)+TX、球形芽孢杆菌 (*Bacillus spahericus*) (**VectoLex®**)+TX、芽孢杆菌属物种+TX、芽孢杆菌属菌株 AQ175+TX、芽孢杆菌属菌株 AQ177+TX、芽孢杆菌属菌株 AQ178+TX、枯草芽孢杆菌菌株 QST 713 (**CEASE®**+TX、**Serenade®**+TX、**Rhapsody®**)+TX、枯草芽孢杆菌菌株 QST 714 (**JAZZ®**)+TX、枯草芽孢杆菌菌株 AQ153+TX、枯草芽孢杆菌菌株 AQ743+TX、枯草芽孢杆菌菌株 QST3002+TX、枯草芽孢杆菌菌株 QST3004+TX、解淀粉枯草芽孢杆菌变种菌株 FZB24 (**Taegro®**+TX、**Rhizopro®**)+TX、苏云金芽孢杆菌 Cry 2Ae+TX、苏云金芽孢杆菌 Cry1Ab+TX、苏云金芽孢杆菌鲇泽 (*Bacillus thuringiensis aizawai*) GC 91 (**Agree®**)+TX、苏云金芽孢杆菌以色列 (*Bacillus thuringiensis israelensis*) (**BMP123®**+TX、**Aquabac®**+TX、**VectoBac®**)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克 (*Bacillus thuringiensis kurstaki*) (**Javelin®**+TX、**Deliver®**+TX、**CryMax®**+TX、**Bonide®**+TX、**Scutella WP®**+TX、**Turilav WP®**+TX、**Astuto®**+TX、**Dipel WP®**+TX、**Biobit®**+TX、**Foray®**)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克 BMP 123 (**Baritone®**)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克 HD-1 (*Bioprotec-CAF/3P®*)+TX、苏云金芽孢杆菌菌株 BD#32+TX、苏云金芽孢杆菌菌株 AQ52+TX、苏云金芽孢杆菌鲇泽变种 (*Bacillus thuringiensis var. aizawai*) (**XenTari®**+TX、**DiPel®**)+TX、细菌属物种 (*bacteria spp.*) (**GROWMEND®**+TX、**GROWSWEET®**+TX、**Shootup®**)+TX、*Clavipacter michiganensis* 噬菌体 (**AgriPhage®**)+TX、**Bakflor®**+TX、球孢白僵菌 (*Beauveria bassiana*) (**Beaugenic®**+TX、**Brocaril WP®**)+TX、球孢白僵菌 GHA (*Mycotrol ES®*+TX、*Mycotrol O®*+TX、**BotaniGuard®**)+TX、布氏白僵菌 (*Beauveria brongniartii*) (**Engerlingspilz®**+TX、**Schweizer Beauveria®**+TX、**Melocont®**)+TX、白僵菌属物种 (*Beauveria spp.*)+TX、灰葡萄孢菌 (*Botrytis cineria*)+TX、大豆慢生型根瘤菌 (*Bradyrhizobium japonicum*) (**TerraMax®**)+TX、短小芽孢杆菌 (*Brevibacillus brevis*)+TX、苏云金芽孢杆菌拟步行甲 (*Bacillus*

thuringiensis tenebrionis) (**Novodor®**)+TX、BtBooster+TX、洋葱伯克霍尔德菌 (*Burkholderia cepacia*) (**Deny®**+TX、**Intercept®**+TX、Blue **Circle®**)+TX、伯克霍尔德菌 (*Burkholderia gladii*)+TX、唐菖蒲伯克霍尔德菌 (*Burkholderia gladioli*)+TX、伯克霍尔德菌属物种 (*Burkholderia* spp.)+TX、加拿大蓟真菌 (Canadian thistle fungus) (CBH Canadian **Bioherbicide®**)+TX、乳酪假丝酵母 (*Candida butyri*)+TX、无名假丝酵母 (*Candida famata*)+TX、*Candida fructus*+TX、光滑念珠菌 (*Candida glabrata*)+TX、吉利蒙念珠菌 (*Candida guilliermondii*)+TX、口津假丝酵母 (*Candida melibiosica*)+TX、橄榄假丝酵母 (*Candida oleophila*) 菌株0+TX、近平滑假丝酵母 (*Candida parapsilosis*)+TX、菌膜假丝酵母 (*Candida pelliculosa*)+TX、铁红假丝酵母 (*Candida pulcherrima*)+TX、瑞氏假丝酵母 (*Candida reukaufii*)+TX、齐藤假丝酵母 (*Candida saitoana*) (Bio-**Coat®**+TX、**Biocure®**)+TX、清酒假丝酵母 (*Candida sake*)+TX、假丝酵母属物种 (*Candida* spp.)+TX、纤细假丝酵母 (*Candida tenuis*)+TX、戴氏西地西菌 (*Cedecea dravisae*)+TX、产黄纤维单胞菌 (*Cellulomonas flavigena*)+TX、螺卷毛壳 (*Chaetomium cochliodes*) (Nova-**Cide®**)+TX、球毛壳菌 (*Chaetomium globosum*) (Nova-**Cide®**)+TX、铁杉紫色杆菌 (*Chromobacterium subtsugae*) 菌株PRAA4-1T (**Grandevo®**)+TX、枝状枝孢菌 (*Cladosporium cladosporioides*)+TX、尖孢枝孢 (*Cladosporium oxysporum*)+TX、绿头枝孢 (*Cladosporium chlorocephalum*)+TX、枝孢属物种 (*Cladosporium* spp.)+TX、极细枝孢霉 (*Cladosporium tenuissimum*)+TX、粉红粘帚霉 (*Clonostachys rosea*) (**EndoFine®**)+TX、尖孢炭疽菌 (*Colletotrichum acutatum*)+TX、盾壳霉 (*Coniothyrium minitans*) (Cotans **WG®**)+TX、盾壳霉属物种 (*Coniothyrium* spp.)+TX、浅白隐球酵母 (*Cryptococcus albidus*) (**YIELDPLUS®**)+TX、土生隐球菌 (*Cryptococcus humicola*)+TX、隐球酵母属 *infirmitus*-*miniatus*+TX、罗伦隐球酵母 (*Cryptococcus laurentii*)+TX、苹果异形小卷蛾颗粒体病毒 (*Cryptophlebia leucotreta* granulovirus) (**Cryptex®**)+TX、*Cupriavidus campinensis*+TX、苹果蠹蛾颗粒体病毒 (*Cydia pomonella* granulovirus) (CYD-**X®**)+TX、苹果蠹蛾颗粒体病毒 (**Madex®**)+TX、**Madex Plus®**+TX、**Madex Max/Carpovirusine®**)+TX、*Cylindrobasidium laeve* (**Stumpout®**)+TX、枝双孢霉属 (*Cylindrocladium*) +TX、汉逊德巴利酵母 (*Debaryomyces hansenii*)+TX、*Drechslera hawaiiensis*+TX、阴沟肠杆菌 (*Enterobacter cloacae*)+TX、肠杆菌科 (*Enterobacteriaceae*) +TX、毒力虫霉 (*Entomophthora virulenta*) (**Vektor®**) +TX、附球菌 (*Epicoccum nigrum*)+TX、黑附球菌 (*Epicoccum purpurascens*)+TX、附球菌属物种+TX、*Filobasidium floriforme*+TX、锐顶镰孢菌+TX、厚孢镰刀菌+TX、尖孢镰刀菌 (**Fusaclean®/Biofox C®**)+TX、层出镰刀菌+TX、镰刀菌属物种+TX、白地霉 (*Galactomyces geotrichum*)+TX、链孢粘帚霉 (*Gliocladium catenulatum*) (**Primastop®**+TX、**Prestop®**)+TX、粉红粘帚霉 (*Gliocladium roseum*)+TX、粘帚霉属物种 (**SoilGard®**)+TX、绿粘帚霉 (**Soilgard®**)+TX、颗粒体病毒 (**Granupom®**)+

TX、嗜盐盐芽孢杆菌(*Halobacillus halophilus*)+TX、岸喜盐芽孢杆菌(*Halobacillus litoralis*)+TX、特氏盐芽孢杆菌(*Halobacillus trueperi*)+TX、盐单胞菌属物种+TX、冰下盐单胞菌(*Halomonas subglaciescola*)+TX、多变盐弧菌(*Halovibrio variabilis*)+TX、葡萄汁有孢汉逊酵母+TX、棉铃虫核型多角体病毒(**Helicovex®**)+TX、谷实夜蛾核型多角体病毒(**Gemstar®**)+TX、异黄酮-芒柄花黄素(**Myconate®**)+TX、柠檬克勒克酵母+TX、克勒克酵母属物种+TX、大链壶菌(*Lagenidium giganteum*) (**Laginex®**)+TX、长孢蜡蚧菌(*Lecanicillium longisporum*) (**Vertiblast®**)+TX、蝇蚧疥霉(*Lecanicillium muscarium*) (**Vertikil®**)+TX、舞毒蛾核型多角体病毒(**Disparvirus®**)+TX、嗜盐海球菌+TX、格氏梅拉菌(*Meira geulakonigii*)+TX、绿僵菌(**Met52®**)+TX、绿僵菌(*DestruxinWP®*)+TX、*Metschnikowia fruticola* (**Shemer®**)+TX、美极梅奇酵母(*Metschnikowia pulcherrima*)+TX、*Microdochium dimerum* (**Antibot®**)+TX、天蓝色小单孢菌(*Micromonospora coerulea*)+TX、*Microsphaeropsis ochracea*+TX、恶臭白色真菌(*Muscodor albus*) 620 (**Muscudor®**)+TX、*Muscodor roseus*菌株A3-5+TX、菌根属物种(*Mycorrhizae spp.*) (**AMykor®**+TX、**Root Maximizer®**)+TX、疣孢漆斑菌菌株AARC-0255 (**DiTera®**)+TX、**BROS PLUS®**+TX、*Ophiostoma piliferum*菌株D97 (**Sylvanex®**)+TX、粉质拟青霉(*Paecilomyces farinosus*)+TX、玫烟色拟青霉(PFR-97®)+TX、**PreFeRal®**)+TX、淡紫拟青霉(*Paecilomyces lilacinus*) (**Biostat WP®**)+TX、淡紫拟青霉菌株251 (**MeloCon WG®**)+TX、多粘类芽孢杆菌+TX、成团泛菌(**BlightBan C9-1®**)+TX、泛菌属物种+TX、巴斯德氏芽菌属物种(**Econem®**)+TX、拟斯扎瓦巴氏杆菌(*Pasteuria nishizawae*)+TX、黄灰青霉+TX、拜赖青霉(*Penicillium billai*) (**Jumpstart®**+TX、**TagTeam®**)+TX、短密青霉+TX、常现青霉+TX、灰黄青霉+TX、产紫青霉+TX、青霉菌属物种+TX、纯绿色青霉+TX、大伏革菌(*Phlebiopsis gigantea*) (**Rotstop®**)+TX、解磷细菌(**Phosphomeal®**)+TX、隐地疫霉+TX、棕榈疫霉(**Devine®**)+TX、异常毕赤酵母+TX、季也蒙毕赤酵母(*Pichia guillemontii*)+TX、膜醭毕赤氏酵母+TX、指甲毕赤酵母+TX、树干毕赤酵母+TX、铜绿假单胞菌+TX、致金色假单胞菌(*Pseudomonas aureofasciens*) (**Spot-Less Biofungicide®**)+TX、洋葱假单胞菌+TX、绿针假单胞菌(**AtEze®**)+TX、皱褶假单胞菌(*Pseudomonas corrugate*)+TX、荧光假单胞菌株A506(**BlightBan A506®**)+TX、恶臭假单胞菌+TX、*Pseudomonas reactans*+TX、假单胞菌属物种+TX、丁香假单胞菌(**Bio-Save®**)+TX、绿黄假单胞菌+TX、荧光假单胞菌(**Zequanox®**)+TX、*Pseudozyma flocculosa*菌株PF-A22 UL (**SporodexL®**)+TX、纵沟柄锈菌(*Puccinia canaliculata*)+TX、*Puccinia thlaspeos* (**WoodWarrior®**)+TX、侧雄腐霉菌(*Pythium oligandrum*)+TX、寡雄腐霉(**Polygandron®**+TX、**Polyversum®**)+

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

菌株94671+TX、黑细基格孢 (*Ulocladium atrum*)+TX、奥德曼细基格孢 (*Ulocladium oudemansii*) (Botry-**Zen®**)+TX、玉蜀黍黑粉菌 (*Ustilago maydis*)+TX、各种细菌和补充微量营养素 (Natural **II®**)+TX、各种真菌 (Millennium **Microbes®**)+TX、厚垣轮枝孢菌 (*Verticillium chlamyosporium*)+TX、蜡蚧轮枝菌 (*Verticillium lecanii*) (**Mycotal®**+TX、**Vertalec®**)+TX、Vip3Aa20 (**VIPTera®**)+TX、死海枝芽孢杆菌 (*Virgibacillus marismortui*)+TX、野油菜黄单胞菌pv.Poae (**Camperico®**)+TX、伯氏致病杆菌+TX、嗜线虫致病杆菌;以及

[0687] 植物提取物,包括:松树油 (**Retenol®**)+TX、印楝素 (Plasma Neem **Oil®**+TX、**AzaGuard®**+TX、**MeemAzal®**+TX、Molt-**X®**+TX、植物IGR (**Neemazad®**+TX、**Neemix®**)+TX、芥花油 (Lilly Miller **Vegol®**)+TX、土荆芥 (*Chenopodium ambrosioides* near *ambrosioides*) (**Requiem®**)+TX、菊花提取物 (**Crisant®**)+TX、印楝油提取物 (**Trilogy®**)+TX、唇形科 (Labiatae) 精油 (**Botania®**)+TX、丁香-迷迭香-胡椒薄荷和百里香油提取物 (Garden insect **killer®**)+TX、甜菜碱 (**Greenstim®**)+TX、大蒜+TX、柠檬草油 (**GreenMatch®**)+TX、印楝油+TX、猫薄荷 (*Nepeta cataria*) (猫薄荷油)+TX、*Nepeta Catarina*+TX、烟碱+TX、牛至油 (**MossBuster®**)+TX、胡麻科 (Pedaliaceae) 油 (**Nematon®**)+TX、除虫菊+TX、皂皮树 (*Quillaja saponaria*) (**NemaQ®**)+TX、大虎杖 (*Reynoutria sachalinensis*) (**Regalia®**+TX、**Sakalia®**)+TX、鱼藤酮 (Eco **Roten®**)+TX、芸香科 (Rutaceae) 植物提取物 (**Soleo®**)+TX、大豆油 (Ortho **ecosense®**)+TX、茶树油 (Timorex **Gold®**)+TX、百里香油+TX、**AGNIQUE®** MMF+TX、**BugOil®**+TX、迷迭香-芝麻-胡椒薄荷-百里香和肉桂提取物混合物 (EF **300®**)+TX、丁香-迷迭香和胡椒薄荷提取物混合物 (EF **400®**)+TX、丁香-胡椒薄荷-大蒜油和薄荷混合物 (**Soil Shot®**)+TX、高岭土 (**Screen®**)+TX、褐藻的贮存葡聚糖 (**Laminarin®**);以及

[0688] 信息素,包括:黑头萤火虫信息素 (3M Sprayable Blackheaded Fireworm **Pheromone®**)+TX、苹果蠹蛾信息素 (Paramount dispenser- (CM)/Isomate C-**Plus®**)+TX、葡萄小卷叶蛾信息素 (3M MEC-GBM Sprayable **Pheromone®**)+TX、卷叶虫信息素 (3M MECLR Sprayable **Pheromone®**)+TX、家蝇信息素 (Muscamone) (Snip7Fly **Bait®**)+TX、Starbar Premium Fly **Bait®**)+TX、梨小食心虫信息素 (3M oriental fruit moth sprayable **pheromone®**)+TX、桃透翅蛾 (Peachtree Borer) 信息素 (Isomate-**P®**)+TX、番茄蛴虫 (Tomato Pinworm) 信息素 (3M Sprayable **pheromone®**)+TX、衣透斯特粉末 (Entostat powder) (来自棕榈树的提取物) (Exosex **CM®**)+TX、(E+TX,Z+TX,Z)-3+TX,8+TX,11十四碳三烯乙酸酯+TX、(Z+TX,Z+TX,E)-7+TX,11+TX,13-十六三烯醛+TX、(E+TX,Z)-7

+TX,9-十二碳二烯-1-基乙酸酯+TX、2-甲基-1-丁醇+TX、乙酸钙+TX、**Scenturion®**+TX、**Biolure®**+TX、Check-**Mate®**+TX、薰衣草千里酸酯(Lavandulyl senecioate);以及 [0689] 宏生物剂(Microbial),包括:短距蚜小蜂+TX、阿尔蚜茧蜂(Aphidius ervi)(Aphelinus-**System®**)+TX、Acerophagus papaya+TX、二星瓢虫(Adalia-**System®**)+TX、二星瓢虫(**Adaline®**)+TX、二星瓢虫(**Aphidalia®**)+TX、串茧跳小蜂(Ageniaspis citricola)+TX、巢蛾多胚跳小蜂+TX、安德森钝绥螨(Amblyseius andersoni)(**Anderline®**+TX、Andersoni-**System®**)+TX、加州钝绥螨(Amblyseius californicus)(**Amblyline®**+TX、**Spical®**)+TX、黄瓜钝绥螨(**Thripex®**+TX、Bugline **cucumeris®**)+TX、伪钝绥螨(**Fallacis®**)+TX、斯氏钝绥螨(Bugline **swirskii®**+TX、Swirskii-**Mite®**)+TX、奥氏钝绥螨(**WomerMite®**)+TX、粉虱细蜂(Amitus hesperidum)+TX、原樱翅缨小蜂(Anagrus atomus)+TX、暗腹长索跳小蜂(Anagrus fusciventris)+TX、卡玛长索跳小蜂(Anagrus kamali)+TX、Anagrus loeckii+TX、粉蚧长索跳小蜂(Anagrus pseudococci)(**Citripar®**)+TX、红蜡蚧扁角跳小蜂(Anicetus benefices)+TX、金小蜂(Anisopteromalus calandrae)+TX、林地花蝽(Anthocoris nemoralis)(Anthocoris-**System®**)+TX、短距蚜小蜂(**Apheline®**+TX、**Aphiline®**)+TX、短翅蚜小蜂(Aphelinus asychis)+TX、棉蚜寄生蜂(Aphidius colemani)(**Ahipar®**)+TX、阿尔蚜茧蜂(**Ervipar®**)+TX、烟蚜茧蜂+TX、桃赤蚜蚜茧蜂(Ahipar-**M®**)+TX、食蚜瘿蚊(**Aphidend®**)+TX、食蚜瘿蚊(**Aphidoline®**)+TX、岭南黄蚜小蜂+TX、印巴黄蚜小蜂+TX、哈氏长尾啮小蜂(Aprostocetus hagenowii)+TX、蚁形隐翅甲(Atheta coriaria)(**Staphyline®**)+TX、熊蜂属物种+TX、欧洲熊蜂(Natupol **Beehive®**)+TX、欧洲熊蜂(**Beeline®**+TX、**Tripol®**)+TX、Cephalonomia stephanoderis+TX、黑背唇瓢虫(Chilocorus nigritus)+TX、普通草蛉(Chrysoperla carnea)(**Chrysoline®**)+TX、普通草蛉(**Chrysopa®**)+TX、红通草蛉(Chrysoperla rufilabris)+TX、Cirrospilus ingenuus+TX、四带瑟姬小蜂(Cirrospilus quadristriatus)+TX、白星橘啮小蜂(Citrostichus phyllocnistoides)+TX、Closterocerus chamaeleon+TX、Closterocerus属物种+TX、Coccidoxenoides perminutus(**Planopar®**)+TX、泊蚜小蜂(Coccophagus cowperi)+TX、赖食蚧蚜小蜂(Coccophagus lycimnia)+TX、螟黄足盘绒茧蜂+TX、菜蛾绒茧蜂+TX、孟氏隐唇瓢虫(**Cryptobug®**+TX、**Cryptoline®**)+TX、日本方头甲+TX、西伯利亚离颚茧蜂+TX、西伯利亚离颚茧蜂(**Minusa®**)+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂(**Diminex®**)+TX、小黑瓢虫(Delphastus catalinae)(**Delphastus®**)+TX、Delphastus pusillus+TX、Diachasmimorpha krausii+TX、长尾潜蝇茧蜂+TX、Diaparsis jucunda+TX、阿里食虱跳小蜂(Diaphorencyrtus



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

)+TX、大臀小花蝽 (*Orius majusculus*) (**Oriline m®**)+TX、小黑花椿象 (*Thripomor-S®*)+TX、*Pauesia juniperorum*+TX、瓢虫柄腹姬小蜂 (*Pediobius foveolatus*) +TX、*Phasmarhabditis hermaphrodita* (**Nemaslug®**)+TX、*Phymastichus coffea*+TX、粗毛小植绥螨 (*Phytoseiulus macropilus*) +TX、智利小植绥螨 (**Spidex®**+TX、**Phytoline p®**) +TX、斑腹刺益蝽 (**Podisus®**)+TX、寄生性蚤蝇 (*Pseudacteon*) *curvatus*+TX、寄生性蚤蝇 (*Pseudacteon*) *obtusus*+TX、寄生性蚤蝇 (*Pseudacteon*) *tricuspis*+TX、*Pseudaphycus maculipennis*+TX、*Pseudleptomastix mexicana*+TX、具毛嗜木虱跳小蜂 (*Psyllaephagus pilosus*) +TX、同色短背茧蜂 (*Psytalia concolor*) (复合物)+TX、胯姬小蜂属物种 (*Quadrastichus* spp.)+TX、*Rhyzobius lophanthae*+TX、澳洲瓢虫+TX、*Rumina decollate*+TX、*Semielacher petiolatus*+TX、麦长管蚜 (**Ervibank®**)+TX、小卷蛾斯氏线虫 (*Nematac C®* +TX、**Millenium®** +TX、*BioNem C®* +TX、**NemAttack®**+TX、**Nemastar®**+TX、**Capsanem®**) +TX、夜蛾斯氏线虫 (**NemaShield®**+TX、*Nemasys F®* +TX、*BioNem F®* +TX、*Steinernema-System®* +TX、**NemAttack®**+TX、**Nemaplus®**+TX、*Exhibitline sf®*+TX、*Scia-rid®*+TX、**Entonem®**) +TX、锯蜂线虫 (*Steinernema kraussei*) (*Nemasys L®*+TX、*BioNem L®*+TX、*Exhibitline srb®*) +TX、锐比斯氏线虫 (*Steinernema riobrave*) (**BioVector®**+TX、**BioVektor®**) +TX、蝼蛄斯氏线虫 (*Steinernema scapterisci*) (*Nematac S®*) +TX、斯氏线虫属物种+TX、斯氏科 (*Steinernematid*) 属物种 (**Guardian Nematodes®**) +TX、深点食螨瓢虫 ; (**Stethorus®**) +TX、亮腹釉小蜂+TX、*Tetrastichus setifer*+TX、*Thripobius semiluteus*+TX、中华长尾小蜂 (*Torymus sinensis*) +TX、甘蓝夜蛾赤眼蜂 (*Tricholine b®*) +TX、甘蓝夜蛾赤眼蜂 (*Tricho-Strip®*) +TX、广赤眼蜂+TX、微小赤眼蜂+TX、玉米螟赤眼蜂+TX、宽脉赤眼蜂 (*Trichogramma platneri*) +TX、短管赤眼蜂+TX、螟黑点瘤姬蜂 (*Xanthopimpla stemmator*) ; 以及

[0690] 其他生物制剂, 包括: 脱落酸+TX、**bioSea®**+TX、银叶菌 (*Chondrostereum purpureum*) (**Chontrol Paste®**) +TX、盘长孢状刺盘孢 (**Collego®**) +TX、辛酸铜 (**Cueva®**) +TX、 $\delta$ 捕捉物 (Delta trap) (**Trapline d®**) +TX、解淀粉欧文氏菌 (*Harpin*) (**ProAct®**+TX、*Ni-HIBIT Gold CST®*) +TX、磷酸高铁 (**Ferramol®**) +TX、漏斗捕捉物 (Funnel trap) (**Trapline y®**) +TX、**Gallex®**+TX、*Grower's Secret®*+TX、高油菜素内酯 (*Homo-brassonolide*) +TX、磷酸铁 (*Lilly Miller Worry Free Ferramol Slug&Snail Bait®*) +TX、MCP冰雹捕捉物 (hail trap) (**Trapline f®**) +TX、寄生性昆虫南美食甲茧蜂 (*Microctonus hyperodae*) +TX、*Mycocleptodiscus terrestris* (**Des-X®**) +TX、**BioGain®**+TX、**Aminomite®**+TX、**Zenox®**+TX、信息素罗网 (*Thripline ams®*) +TX、碳酸氢钾 (**MilStop®**) +TX、脂肪酸的钾盐 (**Sanova®**) +TX、硅酸钾溶液 (*Sil-*

**Matrix®**)+TX、碘化钾+硫氰酸钾(**Enzicur®**)+TX、SuffOil-**X®**+TX、蜘蛛毒+TX、蝗虫微孢子虫 (Semaspore Organic Grasshopper **Control®**)+TX、粘捕捉物 (Trapline **YF®**)+TX、Rebell **Amarillo®**)+TX以及捕捉物 (Takitrapline y+**b®**)+TX;或选自以下的生物活性化合物或试剂:溴氟菊酯+TX、氟螨嗪 (Diflovidazine)+TX、Flometoquin+TX、Fluhexafon+TX、小菜蛾颗粒体病毒+TX、苹果蠹蛾颗粒体病毒+TX、新烟磷 (Imicyafos)+TX、烟芽夜蛾核多角体病毒+TX、Heliothis punctigera核多角体病毒+TX、玉米穗夜蛾核多角体病毒+TX、草地贪夜蛾核多角体病毒+TX、小菜蛾核多角体病毒+TX、对伞花炔+TX、Pyflubumide+TX、Pyrafluprole+TX、QRD 420+TX、QRD452+TX、QRD 460+TX、萜类混合物+TX、萜类+TX、氟氰虫酰胺 (Tetraniliprole)+TX和 $\alpha$ -萜品烯+TX;

[0691] 或由以下代码提及的活性物质+TX,如代码AE 1887196 (BSC-BX60309)+TX、代码NNI-0745GR+TX、代码IKI-3106+TX、代码JT-L001+TX、代码ZNQ-08056+TX、代码IPPA152201+TX、代码HNPC-A9908 (CAS:[660411-21-2])+TX、代码HNPC-A2005 (CAS:[860028-12-2])+TX、代码JS118+TX、代码ZJ0967+TX、代码ZJ2242+TX、代码JS7119 (CAS:[929545-74-4])+TX、代码SN-1172+TX、代码HNPC-A9835+TX、代码HNPC-A9955+TX、代码HNPC-A3061+TX、代码Chuanhua 89-1+TX、代码IPP-10+TX、代码ZJ3265+TX、代码JS9117+TX、代码ZJ3757+TX、代码ZJ4042+TX、代码ZJ4014+TX、代码ITM-121+TX、代码DPX-RAB55 (DKI-2301)+TX、代码NA-89+TX、代码MIE-1209+TX、代码MCI-8007+TX、代码BCS-CL73507+TX、代码S-1871+TX、代码DPX-RDS63+TX、Quinofumelin+TX、氯氟醚菌唑+TX、fenpicoxamid+TX、氟茚唑菌胺+TX、inpyrfluxam+TX或indiflumetpyr+TX、isoflucypram+TX、pyrapropoyne+TX、florylpicoxamid+TX、metyltetraprole+TX、ipflufenquin+TX、pyridachlometyl+TX或chlopyridiflu+TX、四氯虫酰胺 (tetrachlorantraniliprole)+TX、tetrachloraniliprole+TX、Tetflupyrolimet+TX、Triflufenpyrrolidone+TX、Tyclopyrazoflor+TX、flupyrimin+TX或pyrifluramide+TX、benzpyrimoxan+TX、beflubutamid-M+TX、Benzosufyl+TX或oxazosulfyl+TX、乙唑螨腈 (etpyrafen)+TX、acynonapyr+TX或pyrinonafen+TX、氧代三酮 (oxotrione)+TX、bixlozone+TX或clofendizone+TX或dicloroxizone+TX、cyclopyranil+TX或pyrazocyclonil+TX或cyclopyrazonil+TX、 $\alpha$ -溴敌隆+TX、代码AKD-1193+TX、Oxathiapiprolin+TX、Fluopyram+TX、Penflufen+TX、Fluoxopyrosad+TX、fluoxapiprolin+TX以及Flupyradifurone+TX。

[0692] 在活性成分之后的括号中的参考,例如[3878-19-1]是指化学文摘登记号。上文描述的混合配伍物是已知的。当活性成分包括在“The Pesticide Manual[杀有害生物剂手册]”[The Pesticide Manual-A World Compendium[杀有害生物剂手册-全球概览];第13版;编辑:C.D.S.TomLin;The British Crop Protection Coimcil[英国农作物保护委员会]]中,它们在其中以上文对于特定化合物的圆括号中所给出的条目编号来描述;例如化合物“阿巴美丁”以条目编号(1)来描述。其中“[CCN]”是对于上文的特定化合物来加上的,所述的化合物包括在“Compendium of Pesticide Common Names[农药通用名概要]”中,其可以在互联网[A.Wood;Compendium of Pesticide Common Names, Copyright © 1995-2004]上获得;例如,化合物“乙酰虫腈”描述于互联网地址<http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>中。

[0693] 多数活性成分通过上文中所谓的“通用名”来表示,在不同的情形中使用相应的“ISO通用名”或其它“通用名”。若名称不是“通用名”,则所使用的名称种类以特定化合物的圆括号中所给出的名称来代替;在这种情况下,使用IUPAC名称、IUPAC/化学文摘名、“化学名称”、“惯用名”、“化合物名称”或“开发代码”,或若既不使用那些名称之一也不使用“通用名”,则使用“别名”。“CAS登记号”意指化学文摘登记号。

[0694] 选自表A-1至A-17和B-1至B-2和表P的具有式I的化合物与上述活性成分的活性成分混合物包含选自表A-1至表A-17和B-1至B-2和表P的化合物和如上所述的活性成分,它们优选地处于从100:1至1:6000,尤其是从50:1至1:50的混合比,更尤其是处于从20:1至1:20的比率,甚至更尤其是从10:1至1:10,非常尤其是从5:1和1:5,特别优选的从2:1至1:2的比率,并且同样优选的是从4:1至2:1的比率,尤其是1:1、或5:1、或5:2、或5:3、或5:4、或4:1、或4:2、或4:3、或3:1、或3:2、或2:1、或1:5、或2:5、或3:5、或4:5、或1:4、或2:4、或3:4、或1:3、或2:3、或1:2、或1:600、或1:300、或1:150、或1:35、或2:35、或4:35、或1:75、或2:75、或4:75、或1:6000、或1:3000、或1:1500、或1:350、或2:350、或4:350、或1:750、或2:750、或4:750的比率。那些混合比率是按重量计的。

[0695] 如上所述的混合物可以被用于控制有害生物的方法中,所述方法包括将含如上文所述的混合物的组合物施用于有害生物或其环境中,通过手术或疗法用于处理人或动物体的方法以及在人或动物体上实施的诊断方法除外。

[0696] 包含选自表A-1至A-17和B-1至B-2和表P的具有式I的化合物和一种或多种如上所述的活性成分的混合物可以例如如下施用:以单一的“掺水即用”的形式,以组合式喷雾混合物(所述混合物由单一活性成分组分的单独配制品构成,例如“桶混剂”),以及当以顺序方式(即,一个在另一个适度短的时间段之后,如几小时或几天)施用时组合使用这些单一活性成分。施用选自表A-1至A-17和B-1至B-2和表P的具有式I的化合物和如上文所述的活性成分的顺序对于实施本发明并不是至关重要的。

[0697] 根据本发明的组合物还可以包含其他固体或液体助剂,例如稳定剂,例如未环氧化的或环氧化的植物油(例如环氧化的椰子油、菜籽油或大豆油),消泡剂(例如硅酮油),防腐剂,粘度调节剂,粘合剂和/或增粘剂,肥料或其他用于获得特定效果的活性成分,例如杀细菌剂、杀真菌剂、杀线虫剂、植物活化剂、杀软体动物剂或除草剂。

[0698] 根据本发明的组合物是以本身已知的方式,在不存在助剂的情况下,例如通过研磨、筛选和/或压缩固体活性成分;和在至少一种助剂的存在下,例如通过紧密混合活性成分与一种或多种助剂和/或将活性成分与一种或多种助剂一起研磨来制备。用于制备组合物的这些方法和用于制备这些组合物的化合物I的用途也是本发明的主题。

[0699] 这些组合物的施用方法,即控制上述类型的有害生物的方法,如喷雾、雾化、撒粉、刷涂、包衣、撒播或浇灌-它们被选择以适于普遍情况的预期目的-以及这些组合物用于控制上述类型的有害生物用途是本发明的其他主题。典型的浓度比是在0.1与1000ppm之间、优选在0.1与500ppm之间的活性成分。每公顷的施用量总体上是每公顷1g至2000g活性成分、尤其是10g/ha至1000g/ha、优选地是10g/ha至600g/ha。

[0700] 在作物保护领域中,优选的施用方法是施用至这些植物的叶(叶施用),可能的是选择施用的频率和比率以符合所讨论的有害生物的侵染风险。可替代地,所述活性成分可以通过根系统(内吸作用)到达植物,这是通过用液体组合物将这些植物的场所浸透或者通

过将呈固体形式的活性成分引入植物的场所(例如引入土壤,例如以颗粒的形式(土施))来实现的。在水稻作物的情况下,这样的颗粒剂可以被计量地加入淹水的稻田中。

[0701] 本发明的化合物及其组合物还适合于植物繁殖材料(例如种子,像果实、块茎或籽粒,或者苗圃植物)的保护,以对抗上述类型的有害生物。可以用所述化合物在种植前对所述繁殖材料进行处理,例如可以在播种前对种子进行处理。可替代地,所述化合物可以施用至种子籽粒(包衣),这是通过将籽粒浸渍入液体组合物中或通过施用固体组合物层实现的。还可能在所述繁殖材料被种植在施用处时施用这些组合物,例如在条播期间将这些组合物施入种子犁沟。这些用于植物繁殖材料的处理方法和如此处理的植物繁殖材料是本发明另外的主题。典型的处理比率将取决于有待控制的植物以及有害生物/真菌,并且通常在每100kg种子1克至200克之间、优选在每100kg种子5克至150克之间,如在每100kg种子10克至100克之间。

[0702] 术语种子包括所有种类的种子以及植物繁殖体,包括但并不限于真正的种子、种子块、吸盘、谷粒、鳞球茎、果实、块茎、谷物、根茎、插条、切割枝条以及类似物并且在优选实施例中意指真正的种子。

[0703] 本发明还包括经具有式I的化合物包衣或处理或含有具有式I的化合物的种子。尽管取决于施用的方法成分的更多或更少的部分可以渗透到所述种子材料中,术语“包衣或处理和/或含有”通常表示在施用的时候,在大多数情况下,所述活性成分在所述种子的表面。当所述种子产品被(再)种植时,它可以吸收活性成分。在实施例中,本发明使得其上粘附有具有式(I)的化合物的植物繁殖材料可供使用。此外,由此使得包括用具有式(I)的化合物处理过的植物繁殖材料的组合物可供使用。

[0704] 种子处理包括本领域中已知的所有适合的种子处理技术,如拌种、种子包衣、种子撒粉、浸种以及种子造粒。可以通过任何已知的方法进行具有式(I)的化合物的种子处理施用,如在种子播种之前或播种/种植过程中对种子进行喷雾或通过撒粉。

[0705] 生物学实例:

[0706] 接下来的实例用来阐明本发明。本发明的某些化合物与已知的化合物的区别可以在于在低施用率下更大的功效,这可以由本领域的普通技术人员使用在实例中概述的实验程序,使用更低的施用率(如果必要的话)例如,50ppm、12.5ppm、6ppm、3ppm、1.5ppm、0.8ppm或0.2ppm来证实。

[0707] 实例B1:烟粉虱(棉花粉虱):摄食/接触活性

[0708] 将棉花叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并且用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后将叶圆片用成年粉虱进行侵染。孵育6天之后,针对死亡率对这些样品进行检查。

[0709] 以下化合物在200ppm施用率下产生至少80%的死亡率:

[0710] P6、P14、P27、P45、和P46。

[0711] 实例B2:黄瓜条叶甲(玉米根虫)

[0712] 将24孔微量滴定板中的置于琼脂层上的玉米芽通过喷雾用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行处理。在干燥之后,用L2期幼虫对板进行侵染(6至10只/孔)。侵染4天之后,相比于未处理样品,针对死亡率和生长抑制对这些样品进行评估。

[0713] 以下化合物在200ppm施用率下给出了两个类别(死亡率或生长抑制)中至少一个

的至少80%的效果:

[0714] P1、P2、P4、P6、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P17、P20、P21、P23、P24、P25、P28、P29、P30、P32、P38、P40、P43、P44、P45、和P46。

[0715] 实例B3:英雄美洲蝽(新热带区褐蝽象)

[0716] 将24孔微量滴定板中的琼脂上的大豆叶片用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后,用N2期若虫对叶片进行侵染。侵染5天之后,相比于未处理样品,针对死亡率和生长抑制对这些样品进行评估。

[0717] 以下化合物在200ppm施用率下给出了两个类别(死亡率或生长抑制)中至少一个的至少80%的效果:

[0718] P2、P4、P5、P6、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P18、P20、P21、P22、P23、P24、P25、P26、P27、P28、P29、P30、P31、P32、P33、P34、P35、P36、P37、P38、P39、P40、P41、P42、P43、P44、P45、P46、和P47。

[0719] 实例B4:西花蓟马(西方花蓟马):摄食/接触活性

[0720] 将向日葵叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并且用从10'000DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。干燥之后,用混合年龄的花蓟马种群对叶圆片进行侵染。侵染7天之后,针对死亡率对这些样品进行评估。

[0721] 以下化合物在200ppm施用率下产生至少80%的死亡率:

[0722] P1、P2、P4、P6、P9、P21、P43、和P46。

[0723] 实例B5:桃蚜(绿色桃蚜虫):摄食/接触活性

[0724] 将向日葵叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并且用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。干燥之后,用混合年龄的蚜虫种群对叶圆片进行侵染。侵染6天之后,针对死亡率对这些样品进行评估。

[0725] 以下化合物在200ppm施用率下产生至少80%的死亡率:

[0726] P2、P4、P5、P6、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P20、P21、P22、P23、P25、P26、P27、P28、P29、P30、P31、P32、P33、P34、P35、P36、P37、P38、P39、P40、P41、P42、P43、P44、P45、和P46。

[0727] 实例B6:桃蚜(绿色桃蚜虫)。内吸活性

[0728] 将受到混合年龄的蚜虫种群侵染的豌豆幼苗的根部直接放在从10'000DMSO储备溶液制备的水性测试溶液中。将幼苗放置在测试溶液中6天之后,针对死亡率对这些样品进行评估。

[0729] 以下化合物在24ppm测试比率下产生至少80%的死亡率:

[0730] P2、P4、P5、P6、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P20、P21、P22、P23、P25、P26、P27、P28、P29、P30、P32、P34、P35、P36、P37、P38、P39、P40、P42、P43、P45、和P46。

[0731] 实例B7:小菜蛾(Plutella xylostella)(小菜蛾(Diamond back moth))

[0732] 将具有人工饲料的24孔微量滴定板用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液通过移液进行处理。在干燥之后,用L2期幼虫对板进行侵染(10至15只/孔)。侵染5天之后,相比于未处理样品,针对死亡率和生长抑制对这些样品进行评估。

[0733] 以下化合物在200ppm施用率下给出了两个类别(死亡率或生长抑制)中至少一个的至少80%的效果:

[0734] P2、P5、P6、P9、P10、P11、P12、P13、P23、P24、P25、P26、P27、P29、P30、P34、P38、P40、P42、P43、和P45。

[0735] 实例B8:海灰翅夜蛾(埃及棉叶虫):拒食活性

[0736] 将棉花叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并且用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后,将叶圆片用五只L1期幼虫进行侵染。侵染之后3天,相比于未处理样品,针对拒食效果对这些样品进行评估。当拒食效果高于未处理样品时,测试样品对海灰翅夜蛾给出了控制。

[0737] 以下化合物在200ppm施用率下产生至少80%的控制:

[0738] P6、P9、P10、P11、P12和P13。

[0739] 实例B9:海灰翅夜蛾(埃及棉叶虫)

[0740] 将棉花叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并且用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后,将叶圆片用五只L1期幼虫进行侵染。侵染3天之后,相比于未处理样品,针对死亡率、拒食效果以及生长抑制对这些样品进行评估。当这些类别(死亡率、拒食效果和生长抑制)中的至少一个高于未处理的样品时,实现测试样品对海灰翅夜蛾的控制。

[0741] 以下化合物在200ppm施用率下产生至少80%的控制:

[0742] P5、P6、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P17、P22、P23、P24、P29、P30、P34、P35、P40、P42、P43、和P45。

[0743] 实例B10:二点叶螨(二斑叶螨):摄食/接触活性

[0744] 将24孔微量滴定板中的琼脂上的豆叶圆片用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。干燥之后,将叶圆片用混合年龄的螨种群进行侵染。在侵染之后8天后,针对混合种群(活动阶段)的死亡率对这些样品进行评估。

[0745] 以下化合物在200ppm施用率下产生至少80%的死亡率:

[0746] P6、P13、P21、P23、P38、P42、P45、和P46。

[0747] 实例B11:烟蓟马(Thrips tabaci)(洋葱蓟马)摄食/接触活性

[0748] 将向日葵叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并且用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后,将叶圆片用混合年龄的蓟马种群进行侵染。侵染6天之后,针对死亡率对这些样品进行评估。

[0749] 以下化合物在200ppm施用率下产生至少80%的死亡率:

[0750] P1和P2。

[0751] 实例B12:小菜蛾(Plutella xylostella)(小菜蛾(Diamond back moth))

[0752] 将具有人工饲料的24孔微量滴定板用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液通过移液进行处理。在干燥之后,将菜蛾属卵吸移穿过塑料模板到凝胶印迹纸上并且用其封闭板。侵染8天之后,相比于未处理样品,针对死亡率和生长抑制对这些样品进行评估。

[0753] 以下化合物在200ppm施用率下给出了两个类别(死亡率或生长抑制)中至少一个的至少80%的效果:P46。

[0754] 实例B13:埃及伊蚊(黄热病蚊子)

[0755] 以在乙醇中200ppm的施用率,将测试溶液施用到12孔组织培养皿中。一旦沉积物

干燥,将五天、两天至五天大的成年雌性埃及伊蚊添加到每个孔中,并且在棉塞中保持10%的蔗糖溶液。引入后一小时,进行击倒评估,并且在引入后24小时和48小时,评估死亡率。

[0756] 以下化合物在48h和/或24h后对埃及伊蚊给出至少80%的控制:

[0757] P2、和P4。

[0758] 实例B14:南方根结线虫:96孔板中幼虫迁移率的体外剖析

[0759] 用TECAN机器人从10'000ppm DMSO储备溶液制备测试溶液,以获得20 $\mu$ L的1000ppm、200ppm、100ppm、50ppm、25ppm和12.5ppm。对于每个浓度生产三个复制品。向每个孔中加入80 $\mu$ L含有100至150个新收获的南方根结线虫第二阶段幼虫的线虫溶液。将板盖上并在室温下在黑暗中储存并孵育24小时。使用成像工具测量经处理的孔中暴露的幼体的迁移率,并与12个未处理复制品的平均值进行比较。

[0760] 以下化合物在200ppm下24h后实现至少80%的控制:

[0761] P5、P6、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P17、P19、P20、P21、P22、P23、P24、P25、P26、P27、P29、P30、P34、P36、P37、P38、P39、P40、P41、P42、P43、P44和P45。

[0762] 实例B15:甜菜胞囊线虫:96孔板中幼虫迁移率的体外剖析

[0763] 用TECAN机器人从10'000ppm DMSO储备溶液制备测试溶液,以获得20 $\mu$ L的500ppm、100ppm、50ppm、25ppm、12.5ppm和6.25ppm。对于每个浓度生产三个复制品。向每个孔中加入80 $\mu$ L含有100至150个新收获的甜菜胞囊线虫第二阶段幼虫的线虫溶液。将板盖上并在室温下在黑暗中储存并孵育24小时。使用成像工具测量经处理的孔中暴露的幼体的迁移率,并与12个未处理复制品的平均值进行比较。

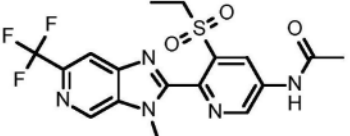
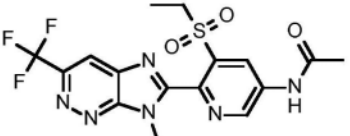
[0764] 以下化合物在100ppm下24h后实现至少80%的控制:

[0765] P28和P45。

[0766] 实例B16:根据本发明的化合物P4与来自现有技术的化合物的杀昆虫活性的比较:

[0767] 表B16总结了根据制备实例的化合物P4和来自WO 2016/104746的化合物4-9对抗黄瓜条叶甲(实例B2)的活性:

[0768] 表B16:

化合物	浓度 (ppm)	昆虫	死亡率 (%)
化合物 P4  (本发明)	200	黄瓜条叶甲	100
4-9, 从 WO 2016/104746 中已知  (现有技术)	200	黄瓜条叶甲	0

[0770] 表B16示出,与现有技术的化合物相比,根据本发明的化合物P4对黄瓜条叶甲发挥

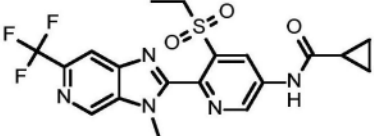
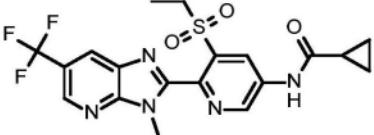


显著更好的杀昆虫作用。基于这些化合物的结构相似性,没有预期到这种增强的效果。

[0771] 实例B17:根据本发明的化合物P2与来自现有技术的化合物的杀昆虫活性的比较:

[0772] 表B17总结了根据制备实例的化合物P2和来自EP 3018130的化合物22(表23)对抗桃蚜(内吸,实例B6)的活性:

[0773] 表B17:

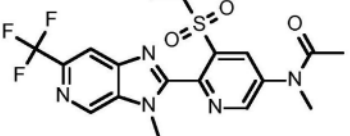
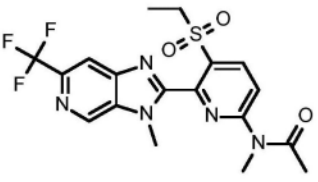
化合物	浓度 (ppm)	昆虫	死亡率 (%)
化合物 P2	1.5	桃蚜(内吸)	80
 (本发明)			
 22, 从 EP 3018130 中已知 (现有技术)	1.5	桃蚜(内吸)	0

[0776] 表B17示出,与现有技术的化合物相比,根据本发明的化合物P2对桃蚜发挥显著更好的杀昆虫作用(内吸活性)。基于这些化合物的结构相似性,没有预期到这种增强的效果。

[0777] 实例B18:根据本发明的化合物P6与来自现有技术的化合物的杀昆虫活性的比较:

[0778] 表B18总结了根据制备实例的化合物P6和来自WO 2016/124557的化合物69对抗以下的活性:桃蚜(MYZUPE,接触,以下实例B19)、桃蚜(MYZUPE,浸湿,以下实例B20)、褐飞虱(NILALU,接触,以下实例B21)、西花蓟马(FRANOC,接触,以下实例B22)和西花蓟马(FRANOC,浸湿,以下实例B23):

[0779] 表B18:

化合物	浓度 (ppm)	昆虫	死亡率 (%)
[0780] 化合物 P6  (本发明)	3	MYZUPE (接触)	70
	0.2	MYZUPE (浸湿)	92.5
	3	NILALU (接触)	80
	50	FRANOC (接触)	98
	3	FRANOC (浸湿)	92.5
	69, 从 WO 2016/124557 中已知	3	MYZUPE (接触)
	0.2	MYZUPE (浸湿)	50
	3	NILALU (接触)	30
[0781]  (现有技术)	50	FRANOC (接触)	0
	3	FRANOC (浸湿)	35

[0782] 测试说明:

[0783] 实例B19:桃蚜(绿色桃蚜虫),混合种群,接触/摄食

[0784] 将辣椒植物用混合年龄的蚜虫种群侵染,并在浸染后1天在喷雾室中用稀释的测试溶液进行处理。处理后5天,评估样品的死亡率。

[0785] 实例B20:桃蚜(绿色桃蚜虫),混合种群,内吸入土壤的

[0786] 将种植在田间土壤中并且在处理前1天用混合年龄的蚜虫种群侵染的豌豆幼苗作为浸湿施用处理并在处理后7天检查死亡率。

[0787] 实例B21:褐飞虱(褐稻飞虱),杀幼虫剂,摄食/接触

[0788] 用稀释的测试溶液在喷雾室中对水稻植物进行处理。在干燥之后,用约20只N3期若虫对植物进行侵染。处理后7天,针对死亡率和生长调节对样品进行评估。

[0789] 实例B22:西花蓟马(西方花蓟马),混合种群,接触/摄食

[0790] 用稀释的测试溶液在喷雾室中对法国豆植物进行处理。干燥后,用混合年龄的蓟马种群侵染植物。在侵染后7天,评估样品的死亡率。

[0791] 实例B23:西花蓟马(西方花蓟马),混合种群,内吸入土壤的

[0792] 经由浸湿施用对在田间土壤中种植的法国豆植物进行处理,并且处理后1天将它们用混合年龄的蓟马种群侵染。在侵染后8天,评估样品的死亡率和植物毒性症状。

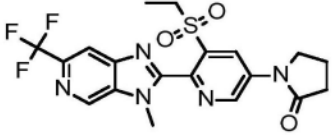
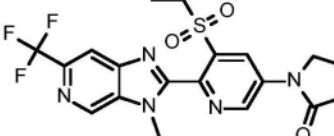
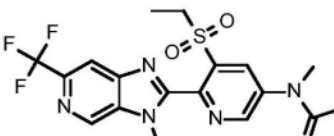
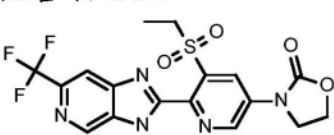
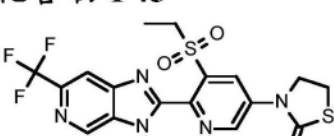
[0793] 表B18示出,与现有技术的化合物相比,根据本发明的化合物P6对桃蚜(内吸活性)发挥显著更好的杀昆虫作用。基于这些化合物的结构相似性,没有预期到这种增强的效果。

[0794] 实例B24:根据本发明的化合物P5、P21、P23、P34、P45、P36和P37与来自现有技术的化合物的杀昆虫活性的比较:

[0795] 表B24总结了根据制备实例的化合物P5、P21、P23、P34、P45、P36和P37,和来自W0

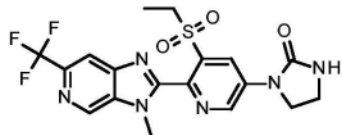
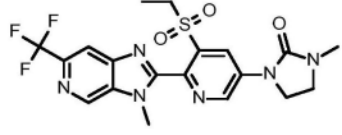
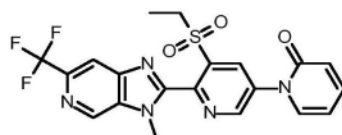
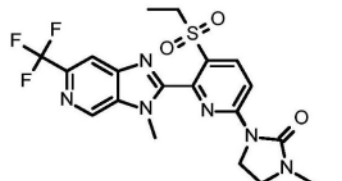
2016030229的化合物P26以及来自W0 2016/124563的化合物44分别对抗桃蚜(摄食/接触, 实例B5)、桃蚜(内吸, 实例B6)和英雄美洲蝽(实例B3)的活性:

[0796] 表B24:

化合物	浓度 (ppm)	昆虫	死亡率 (%)
化合物 P5  (本发明)	12.5 1.5 50	桃蚜(摄食/接触) 桃蚜(内吸) 英雄美洲蝽	0 80 100
化合物 P21  (本发明)	12.5 1.5 50	桃蚜(摄食/接触) 桃蚜(内吸) 英雄美洲蝽	100 100 100
化合物 P23  (本发明)	12.5 1.5 50	桃蚜(摄食/接触) 桃蚜(内吸) 英雄美洲蝽	90 100 100
化合物 P34  (本发明)	12.5 1.5 50	桃蚜(摄食/接触) 桃蚜(内吸) 英雄美洲蝽	100 100 80
化合物 P45  (本发明)	12.5 1.5 50	桃蚜(摄食/接触) 桃蚜(内吸) 英雄美洲蝽	80 50 100

[0797]

[0798]

<p><b>化合物 P36</b></p>  <p>(本发明)</p>	<p><b>12.5</b> <b>1.5</b> <b>50</b></p>	<p>桃蚜 (摄食/接触) 桃蚜 (内吸) 英雄美洲蟥</p>	<p><b>90</b> <b>100</b> <b>100</b></p>
<p><b>化合物 P37</b></p>  <p>(本发明)</p>	<p><b>12.5</b> <b>1.5</b> <b>50</b></p>	<p>桃蚜 (摄食/接触) 桃蚜 (内吸) 英雄美洲蟥</p>	<p><b>90</b> <b>100</b> <b>100</b></p>
<p><b>P26, 从 WO 2016/030229 中已知</b></p>  <p>(现有技术)</p>	<p><b>12.5</b> <b>1.5</b> <b>50</b></p>	<p>桃蚜 (摄食/接触) 桃蚜 (内吸) 英雄美洲蟥</p>	<p><b>0</b> <b>0</b> <b>50</b></p>
<p><b>44, 从 WO 2016/124563 中已知</b></p>  <p>(现有技术)</p>	<p><b>12.5</b> <b>1.5</b> <b>50</b></p>	<p>桃蚜 (摄食/接触) 桃蚜 (内吸) 英雄美洲蟥</p>	<p><b>80</b> <b>0</b> <b>50</b></p>

[0799] 表B24示出,与现有技术的化合物相比,根据本发明的化合物P5、P21、P23、P34、P45、P36和P37对桃蚜(摄食/接触和/或内吸活性)和/或英雄美洲蟥发挥显著更好的杀昆虫作用。基于这些化合物的结构相似性,没有预期到这种增强的效果。