



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 118891256 A

(43) 申请公布日 2024. 11. 01

(21) 申请号 202280079317.1

M·魏斯 M·米尔巴赫

(22) 申请日 2022.12.05

(74) 专利代理机构 中国贸促会专利商标事务所  
有限公司 11038

(30) 优先权数据

202111057521 2021.12.10 IN

专利代理师 徐达

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2024.05.30

(51) Int.Cl.

C07D 403/14 (2006.01)

A01N 43/60 (2006.01)

A01N 43/647 (2006.01)

A01P 7/02 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/EP2022/084409 2022.12.05

(87) PCT国际申请的公布数据

W02023/104714 EN 2023.06.15

(71) 申请人 先正达农作物保护股份公司

地址 瑞士

(72) 发明人 J·P·基拉鲁 M·费德特

S·贝拉多兹 R·G·豪尔

A·珍格纳特 T·皮特纳

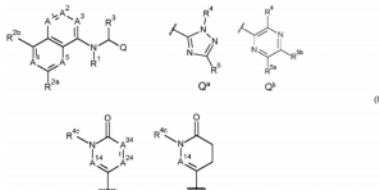
权利要求书5页 说明书146页

(54) 发明名称

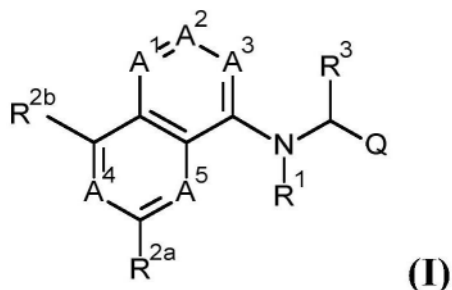
杀有害生物活性的哒嗪酮化合物

(57) 摘要

具有式(I)的化合物,其中Q是Q<sup>a</sup>或Q<sup>b</sup>;并且R<sup>4</sup>是R<sup>4a</sup>或R<sup>4b</sup>,并且其中取代基是如权利要求1所定义的,以及那些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-氧化物可以用作杀昆虫剂。



1. 一种具有式 (I) 的化合物

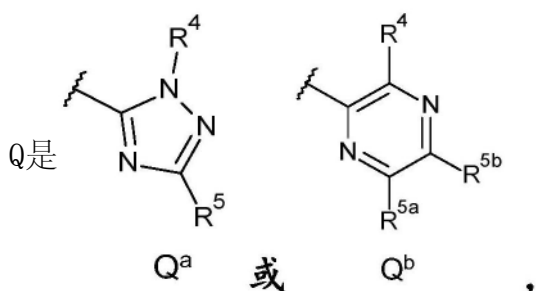


其中:

$A^1$ 、 $A^2$ 和 $A^3$ 彼此独立地是N或 $CR^Y$ ;或者

$A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NR-C(=X)-N$ ;其中X是O或S;

$A^4$ 和 $A^5$ 彼此独立地是N或 $CR^Y$ ;



其中交错线表示Q与具有该式 (I) 的化合物的剩

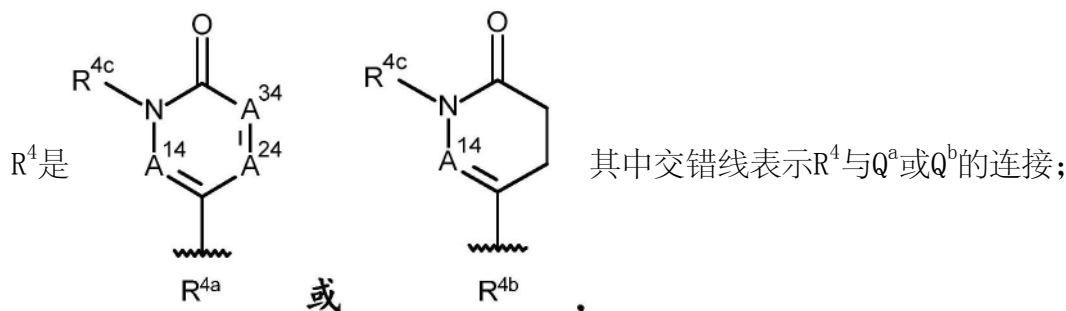
余部分的连接;

R是氢、 $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基、或 $C_1-C_3$ 卤代烷氧基;

$R^1$ 是氢、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 氰基烷基、氨基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、羟基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 硝基烷基、三甲基硅烷 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_2-C_6$ 烯基、 $C_2-C_6$ 卤代烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_2-C_6$ 卤代炔基、 $C_3-C_4$ 环烷基 $C_1-C_2$ 烷基-, 其中 $C_3-C_4$ 环烷基被1或2个卤素原子取代的 $C_3-C_4$ 环烷基 $C_1-C_2$ 烷基-, 氧杂环丁烷-3-基- $CH_2$ -,  $C_1-C_6$ 烷基羰基、 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基、苯基氧基羰基、苄基氧基羰基、苄基或被1至3个独立地选自卤素、 $C_1-C_6$ 烷氧基和 $C_1-C_6$ 卤代烷基的取代基取代的苄基;

$R^{2a}$ 和 $R^{2b}$ 各自独立地选自氢、 $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷基硫烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基、 $C_1-C_3$ 卤代烷氧基、卤素、 $NO_2$ 、 $SF_5$ 、CN、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)OH$ 、 $C(S)NH_2$ 、 $C_3-C_6$ 环烷基、被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的 $C_3-C_6$ 环烷基、 $C_3-C_6$ 环烷基羰基、苯基、被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的苯基、杂芳基、被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的杂芳基、 $OR^6$ 、哌啶-2-酮-1-基、被一至两个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的哌啶-2-酮-1-基、吡啶-2-酮-1-基、被一至两个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的吡啶-2-酮-1-基、氮杂环丁烷-1-基、被一至两个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的氮杂环丁烷-1-基、吡咯烷-1-基、被一至两个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的吡咯烷-1-基、 $C_3-C_6$ 环烷基 $C_1-C_4$ 烷基、被一至两个独立地选自 $R^z$ 的取代基取代的 $C_3-C_6$ 环烷基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_3-C_6$ 环烷基 $C_1-C_3$ 烷氧基、被一至两个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的 $C_3-C_6$ 环烷基 $C_1-C_3$ 烷氧基、 $C_1-C_5$ 氰基烷基、 $C_1-C_5$ 氰基烷氧基、 $C_1-C_4$ 烷基硫烷基、被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的 $C_1-C_4$ 烷基硫烷基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基、被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_4$ 烷基亚磺酰基、和被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的 $C_1-C_4$ 烷基亚磺酰基;

$R^3$ 是 $C_1$ - $C_3$ 烷基或 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基；



$A^{14}$ 、 $A^{24}$ 和 $A^{34}$ 彼此独立地是N或CH；

$R^{4c}$ 是 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、烯丙基、炔丙基或 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_4$ 烷基；

$R^5$ 是氢、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_3$ - $C_4$ 烷氧基C(O)-、( $C_1$ - $C_3$ 烷氧基) $_2$ CH-、卤素、CN、 $NH_2$ C(O)、氨基(即 $NH_2$ )、( $C_1$ - $C_3$ 烷基)氨基、二( $C_1$ - $C_3$ 烷基)氨基、羟基、 $C_3$ - $C_4$ 卤代环烷基、 $C_3$ - $C_4$ 氰基环烷基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_2$ - $C_6$ 卤代烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、 $C_2$ - $C_6$ 卤代炔基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基硫烷基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基亚磺酰基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基硫烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷基、( $C_1$ - $C_3$ 烷基)磺酰基氨基、( $C_1$ - $C_3$ 烷基)磺酰基( $C_1$ - $C_3$ 烷基)氨基、( $C_1$ - $C_3$ 烷基)NHC(O)、( $C_1$ - $C_3$ 烷基) $_2$ NC(O)、( $C_1$ - $C_3$ 环烷基)NHC(O)、( $C_1$ - $C_3$ 环烷基)( $C_1$ - $C_3$ 烷基)NC(O)、( $C_1$ - $C_3$ 烷基)C(O)( $C_1$ - $C_3$ 烷基)N、( $C_1$ - $C_3$ 烷基)C(O)NH、( $C_1$ - $C_3$ 烷基)C(O)、( $C_1$ - $C_3$ 烷氧基)C(O)、HC(O)、二苯基甲亚胺、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基、苯基、或5元杂芳香族环；或者

$R^5$ 是苯基，该苯基被一至三个选自以下的取代基取代： $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基、卤素、CN和羟基；或者

$R^5$ 是5元杂芳香族环，该5元杂芳香族环被一至三个选自以下的取代基取代： $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基、卤素、CN和羟基；

$R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 彼此独立地选自氢、卤素、CN、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、和 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基；

$R^6$ 是苯基、苄基、杂芳基、或 $C_3$ - $C_6$ 环烷基；或者

$R^6$ 是苯基、苄基、杂芳基、或 $C_3$ - $C_6$ 环烷基，其中的每一个彼此独立地被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代；

$R^x$ 独立地选自卤素、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基、 $NO_2$ 、 $SF_5$ 、CN、C(O) $NH_2$ 、C(S) $NH_2$ 、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基硫烷基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基亚磺酰基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基硫烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基和 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基；

$R^y$ 选自氢、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、羟基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基、卤素、CN和环丙基；并且

$R^z$ 选自氧代基、卤素、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基和CN；

或该具有式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。

2. 根据权利要求1所述的化合物，其中， $A^1$ 和 $A^3$ 是N并且 $A^2$ 是 $CR^y$ ；并且 $R^y$ 是氢、氯、甲基、三氟甲基或甲氧基。

3. 根据权利要求1所述的化合物，其中， $A^1=A^2=A^3$ 一起是 $NR-C(=O)-N$ ；并且R是氢、甲

基、乙基、2,2-二氟乙基或2,2,2-三氟乙基。

4. 根据权利要求1至3中任一项所述的化合物,其中, $A^4$ 和 $A^5$ 彼此独立地是N或CH。

5. 根据权利要求1至4中任一项所述的化合物,其中, $A^4$ 和 $A^5$ 都是CH。

6. 根据权利要求1至5中任一项所述的化合物,其中,

- 当 $R^4$ 是 $R^{4a}$ 时: $A^{14}$ 是N, $A^{24}$ 是N或CH,并且 $A^{34}$ 是N或CH;或 $A^{14}$ 是N, $A^{24}$ 是N或CH,并且 $A^{34}$ 是CH;或 $A^{14}$ 是N, $A^{24}$ 是CH,并且 $A^{34}$ 是N或CH;或 $A^{14}$ 是N, $A^{24}$ 是CH,并且 $A^{34}$ 是CH;并且

- 当 $R^4$ 是 $R^{4b}$ 时: $A^{14}$ 是N;或 $A^{14}$ 是CH。

7. 根据权利要求1至6中任一项所述的化合物,其中, $R^{4c}$ 是甲基、乙基、丙基、二氟甲基、三氟甲基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、烯丙基、炔丙基、环丙基甲基、环丁基甲基、2-环丙基乙基、或3-环丙基丙基。

8. 根据权利要求1至7中任一项所述的化合物,其中:

-  $A^{14}$ 是N,并且当 $R^4$ 是 $R^{4a}$ 时, $A^{24}$ 和 $A^{34}$ 是CH;并且

-  $R^{4c}$ 是甲基、或乙基。

9. 根据权利要求1至8中任一项所述的化合物,其中, $X^0$ 是O。

10. 根据权利要求1至9中任一项所述的化合物,其中, $R^1$ 是氢、甲基、乙基、氰基甲基、甲氧基甲基、环丙基-甲基、烯丙基、炔丙基、苄基氧基羰基、或苄基。

11. 根据权利要求1至10中任一项所述的化合物,其中, $R^{2a}$ 是卤素, $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基, $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基硫烷基, $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基氧基,任选地被一或两个独立地选自 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、氰基和卤素的取代基取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基,任选地被一至三个独立地选自 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、氰基和卤素的取代基取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_4$ 烷基, $C_1$ - $C_5$ 氰基烷基, $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基, $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基磺酰基, $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基, $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基亚磺酰基, $C_3$ - $C_6$ 环烷基硫烷基, $C_3$ - $C_6$ 环烷基亚磺酰基,或 $C_3$ - $C_6$ 环烷基磺酰基。

12. 根据权利要求1至11中任一项所述的化合物,其中, $R^{2b}$ 是卤素、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基硫烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基、或CN。

13. 根据权利要求1至12中任一项所述的化合物,其中, $R^{2a}$ 和 $R^{2b}$ 独立地选自氯、溴、碘和三氟甲基。

14. 根据权利要求1至13中任一项所述的化合物,其中, $R^3$ 是 $C_1$ - $C_3$ 烷基。

15. 根据权利要求1至14中任一项所述的化合物,其中, $R^3$ 是甲基。

16. 根据权利要求1至15中任一项所述的化合物,其中:

- 当Q是 $Q^a$ 时: $R^5$ 是氢、甲基、三氟甲氧基、甲氧基、环丙基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、二氟甲氧基、2,2,2-三氟乙基、氯、溴、甲氧基乙氧基、甲基羰基或甲氧基羰基;并且

- 当Q是 $Q^b$ 时: $R^{5a}$ 是氢、卤素、CN、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基或 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基;并且 $R^{5b}$ 是氢、卤素、CN、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基或 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基。

17. 一种组合物,其包含如权利要求1至16中任一项所定义的化合物、一种或多种助剂和稀释剂、以及任选地一种或多种其他活性成分。

18. 一种方法,其为

(i) 用于对抗和控制昆虫、螨、线虫或软体动物的方法,该方法包括向有害生物、有害生物的场所、或易受有害生物攻击的植物施用杀昆虫、杀螨、杀线虫或杀软体动物有效量的如

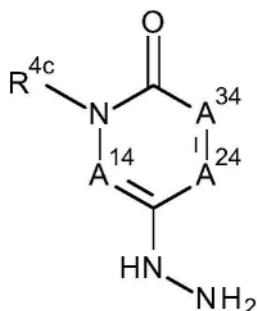
权利要求1至16中任一项所定义的化合物或如权利要求17所定义的组合物;或者

(ii) 用于保护植物繁殖材料免受昆虫、螨、线虫或软体动物的攻击的方法,该方法包括用有效量的如权利要求1至16中任一项所定义的化合物或如权利要求17所定义的组合物处理该繁殖材料或该繁殖材料所种植的场地;或者

(iii) 用于控制有需要的动物体内或体表的寄生虫的方法,该方法包括给予有效量的如权利要求1至16中任一项所定义的化合物或如权利要求17所定义的组合物。

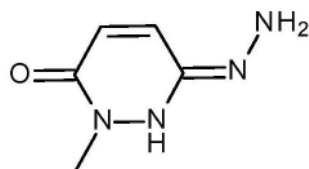
19. 一种植物繁殖材料,如种子,其包含如权利要求1至16中任一项所定义的化合物或如权利要求17所定义的组合物、或用该化合物或该组合物进行处理、或其上粘附有该化合物或该组合物。

20. 一种具有式XII(i)的化合物或其互变异构体,

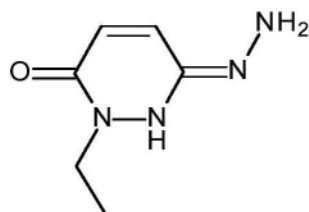


### XII(i)

其中A<sup>14</sup>、A<sup>24</sup>、A<sup>34</sup>和R<sup>4c</sup>是如权利要求1、6、7和8中任一项所定义的,前提是所述化合物不是

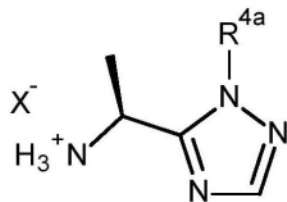


6-甲基-2-甲基-3(2H)-吡嗪酮,也不是其互变异构体;也不是

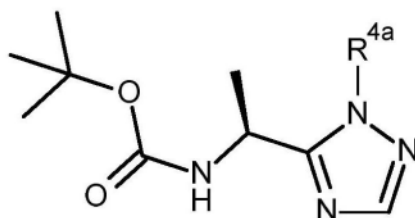


6-甲基-2-乙基-3(2H)-吡嗪酮,也不是其互变异构体。

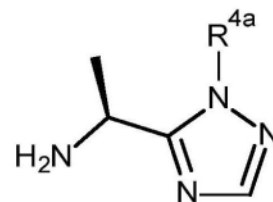
21. 一种具有式XX(i)、XXI(i)或XXII(i)的化合物



### XX(i)



### XXI(i)



### XXII(i)

其中R<sup>4a</sup>是如权利要求1、6和7中任一项所定义的;并且其中X<sup>-</sup>是选自以下的阴离子:  
-选自盐酸、氢溴酸、氟化氢、碘化氢和硫酸的无机酸的共轭碱;以及

-选自羧酸和磺酸的有机酸的共轭碱。

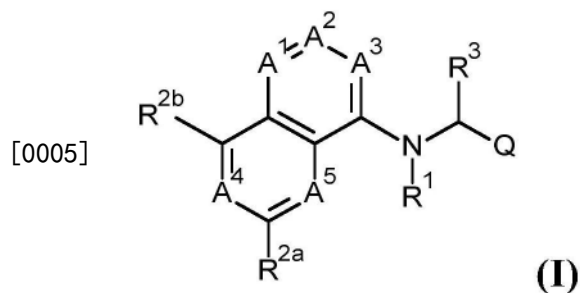
## 杀有害生物活性的哒嗪酮化合物

[0001] 本发明涉及杀有害生物活性的哒嗪酮化合物,例如,作为具有杀有害生物活性的活性成分。本发明还涉及这些哒嗪酮化合物的制备、可用于这些哒嗪酮化合物的制备的中间体、这些中间体的制备、包含这些哒嗪酮化合物中的至少一种的农用化学组合物、这些组合物的制备以及这些哒嗪酮化合物或组合物在农业或园艺中用于控制动物有害生物的用途,这些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。特别地,披露了杀有害生物活性的哒嗪-3-酮化合物。

[0002] WO 2021/083936、WO 2021/148639和WO 2021/177160描述了某些喹唑啉、喹唑啉酮和喹啉化合物。

[0003] 现在已经出人意料地发现某些新哒嗪酮化合物、特别是哒嗪-3-酮化合物具有杀有害生物活性。

[0004] 因此,在第一方面,本发明提供了具有式(I)的化合物,以及其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体和N-氧化物:



[0006] 其中:

[0007]  $A^1$ 、 $A^2$ 和 $A^3$ 彼此独立地是N或 $CR^Y$ ;或者

[0008]  $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NR-C(=X^0)-N$ ;其中 $X^0$ 是O或S;

[0009]  $A^4$ 和 $A^5$ 彼此独立地是N或 $CR^Y$ ;



的剩余部分的连接;

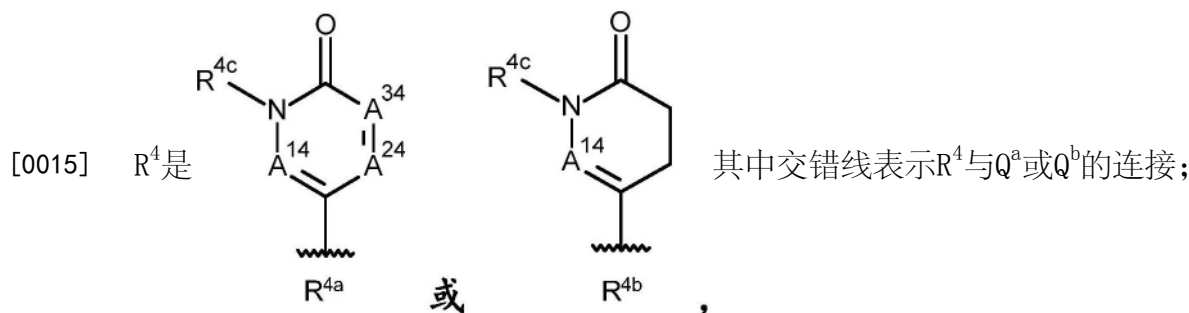
[0011] R是氢、 $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基、或 $C_1-C_3$ 卤代烷氧基;

[0012]  $R^1$ 是氢、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 氰基烷基、氨基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、羟基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 硝基烷基、三甲基硅烷 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_2-C_6$ 烯基、 $C_2-C_6$ 卤代烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_2-C_6$ 卤代炔基、 $C_3-C_4$ 环烷基 $C_1-C_2$ 烷基-,或其中 $C_3-C_4$ 环烷基被1或2个卤素原子取代的 $C_3-C_4$ 环烷基 $C_1-C_2$ 烷基-,氧杂环丁烷-3-基- $CH_2$ -, $C_1-C_6$ 烷基羰基、 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基、苯基氧基羰基、苄基氧基羰基、苄基或被1至3个独立地选自卤素、 $C_1-C_6$ 烷氧基和 $C_1$ -

C<sub>6</sub>卤代烷基的取代基取代的苄基；

[0013] R<sup>2a</sup>和R<sup>2b</sup>各自独立地选自氢、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基硫烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷氧基、卤素、NO<sub>2</sub>、SF<sub>5</sub>、CN、C(O)NH<sub>2</sub>、C(O)OH、C(S)NH<sub>2</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、被一至三个独立地选自R<sup>x</sup>的取代基取代的C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基羰基、苯基、被一至三个独立地选自R<sup>x</sup>的取代基取代的苯基、杂芳基、被一至三个独立地选自R<sup>x</sup>的取代基取代的杂芳基、OR<sup>6</sup>、哌啶-2-酮-1-基、被一至两个独立地选自R<sup>x</sup>的取代基取代的哌啶-2-酮-1-基、吡啶-2-酮-1-基、被一至两个独立地选自R<sup>x</sup>的取代基取代的吡啶-2-酮-1-基、氮杂环丁烷-1-基、被一至两个独立地选自R<sup>x</sup>的取代基取代的氮杂环丁烷-1-基、吡咯烷-1-基、被一至两个独立地选自R<sup>x</sup>的取代基取代的吡咯烷-1-基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、被一至两个独立地选自R<sup>z</sup>的取代基取代的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>环烷基C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基、被一至两个独立地选自R<sup>x</sup>的取代基取代的C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>氰基烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>氰基烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基硫烷基、被一至三个独立地选自R<sup>x</sup>的取代基取代的C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基硫烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基、被一至三个独立地选自R<sup>x</sup>的取代基取代的C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基、和被一至三个独立地选自R<sup>x</sup>的取代基取代的C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基；

[0014] R<sup>3</sup>是C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基或C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基；



[0016] A<sup>14</sup>、A<sup>24</sup>和A<sup>34</sup>彼此独立地是N或CH；

[0017] R<sup>4c</sup>是C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基、烯丙基、炔丙基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基；

[0018] R<sup>5</sup>是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基C(O)-、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基)<sub>2</sub>CH-、卤素、CN、NH<sub>2</sub>C(O)、氨基(即, NH<sub>2</sub>)、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基)氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基)氨基、羟基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>卤代环烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>氰基环烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代炔基、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、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基硫烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基)磺酰基氨基、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基)磺酰基(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基)氨基、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基)NHC(O)、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基)<sub>2</sub>NC(O)、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>环烷基)NHC(O)、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>环烷基)(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基)NC(O)、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基)C(O)(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基)N、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基)C(O)NH、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基)C(O)、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基)C(O)、HC(O)、二苯基甲亚胺、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷氧基、苯基、或5元杂芳香族环；或者

[0019] R<sup>5</sup>是苯基, 该苯基被一至三个选自以下的取代基取代: C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>环烷基、卤素、CN和羟基；或者

[0020] R<sup>5</sup>是5元杂芳香族环, 该5元杂芳香族环被一至三个选自以下的取代基取代: C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>环烷基、卤素、CN和羟基；

[0021] R<sup>5a</sup>和R<sup>5b</sup>彼此独立地选自氢、卤素、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基、和C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷氧基；

[0022]  $R^6$ 是苯基、苄基、杂芳基、或 $C_3$ - $C_6$ 环烷基；或者

[0023]  $R^6$ 是苯基、苄基、杂芳基、或 $C_3$ - $C_6$ 环烷基，其中的每一个彼此独立地被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代；

[0024]  $R^x$ 独立地选自卤素、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基、 $NO_2$ 、 $SF_5$ 、 $CN$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(S)NH_2$ 、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基硫烷基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基亚磺酰基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基硫烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基和 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基；

[0025]  $R^y$ 选自氢、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、羟基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基、卤素、 $CN$ 和环丙基；并且

[0026]  $R^z$ 选自氧代基、卤素、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基和 $CN$ 。

[0027] 本发明还提供了一种制备具有式(I)的化合物的方法以及可用于具有式(I)的化合物的制备的中间体化合物。

[0028] 在第二方面，本发明使得可获得一种组合物，该组合物包含具有式(I)的化合物、一种或多种助剂和稀释剂、以及任选地一种或多种其他活性成分。

[0029] 在第三方面，本发明使得可获得一种对抗和控制昆虫、螨、线虫或软体动物的方法，该方法包括向有害生物、有害生物的场所、或易受有害生物攻击的植物施用杀昆虫、杀螨、杀线虫或杀软体动物有效量的具有式(I)的化合物或包含这样的化合物的组合物。

[0030] 在第四方面，本发明使得可获得一种用于保护植物繁殖材料免受昆虫、螨、线虫或软体动物的攻击的方法，该方法包括用有效量的具有式(I)的化合物或包含这样的化合物的组合物处理该繁殖材料或该繁殖材料所种植的场地。

[0031] 在第五方面，本发明使得可获得一种植物繁殖材料，如种子，其含有具有式(I)的化合物或包含这样的化合物的组合物，或用该化合物或该组合物处理，或其上粘附有该化合物或该组合物。

[0032] 在另一方面，本发明提供了一种控制有需要的动物体内或体表的寄生虫的方法，该方法包括给予有效量的第一方面的化合物。本发明进一步提供了一种控制有需要的动物的体表寄生虫的方法，该方法包括给予有效量的如第一方面中所定义的具有式(I)的化合物。本发明进一步提供了一种用于预防和/或治疗由体表寄生虫传播的疾病的方法，该方法包括对有需要的动物给予有效量的如第一方面中所定义的具有式(I)的化合物。

[0033] 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 $C_1$ - $C_4$ 羧酸，例如乙酸，如饱和或不饱和的二羧酸，例如草酸、丙二酸、琥珀酸、马来酸、富马酸或邻苯二甲酸，如羟基羧酸，例如抗坏血酸、乳酸、苹果酸、酒石酸或柠檬酸，或如苯甲酸），或有机磺酸（如未取代的或例如被卤素取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷磺酸或芳基磺酸，例如甲烷磺酸或对甲苯磺酸）。具有至少一个酸性基团的具有式(I)的化合物可以例如与碱形成盐，例如矿物盐，如碱金属或碱土金属盐，例如钠盐、钾盐或镁盐；或与氨或有机胺（如吗啉，哌啶，吡咯烷，单、二或三低级烷基胺，例如乙胺、二乙胺、三乙胺或二甲基丙基胺，或单、二或三羟基低级烷基胺，例如单乙醇胺、二乙醇胺或三乙醇胺）形成盐。

[0034] 在每种情况下，根据本发明的具有式(I)的化合物呈游离形式、氧化形式（如N-氧化物）、或盐形式（例如，农艺学上可用的盐形式）。

[0035] 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。例如在A.Albini和S.Pietra的书“Heterocyclic N-oxides[杂环N-氧化物]”,CRC Press[CRC出版社],Boca Raton[波卡拉顿]1991中描述了它们。

[0036] 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。

[0037] 如本文使用的术语“ $C_1-C_n$ 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。

[0038] 如本文使用的术语“ $C_1-C_n$ 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。

[0039] 如本文使用的术语“ $C_1-C_n$ 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),该饱和烷基经由氧原子附接,即,例如以下基团中的任一种: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。如本文使用的术语“ $C_1-C_n$ 卤代烷氧基”是指 $C_1-C_n$ 烷氧基,其中烷基上的一个或多个氢原子被一个或多个相同或不同的卤素原子替代-实例包括三氟甲氧基、2-氟乙氧基、3-氟丙氧基、3,3,3-三氟丙氧基、4-氯丁氧基。

[0040] 如本文使用的术语“ $C_1-C_n$ 烷氧基 $C_1-C_m$ 烷基”是指具有1至n个碳原子的烷氧基(如上提及的),其经由氧原子附接至具有1至m个碳原子的烷基(如上提及的)上,该烷基连接至分子的剩余部分。

[0041] 如本文使用的术语“ $C_1-C_n$ 氰基烷基”是指具有1至n个碳原子的直链或支链饱和的 $C_1-C_n$ 烷基(如上提及的),其中这些基团中的氢原子之一被氰基-CN替代:例如,氰基甲基、2-氰基乙基、2-氰基丙基、3-氰基丙基、1-(氰基甲基)-2-乙基、1-(甲基)-2-氰基乙基、4-氰基丁基等。

[0042] 如本文使用的术语“ $C_1-C_n$ 硝基烷基”是指具有1至n个碳原子的直链或支链饱和的 $C_1-C_n$ 烷基(如上提及的),其中这些基团中的氢原子之一被硝基- $NO_2$ 替代:例如,硝基甲基、2-硝基乙基、2-硝基丙基、3-硝基丙基、1-(硝基甲基)-2-乙基、1-(甲基)-2-硝基乙基、4-硝基丁基等。

[0043] 如本文使用的术语“C<sub>3</sub>-C<sub>n</sub>环烷基”是指3元-n元环烷基,如环丙烷、环丁烷、环戊烷和环己烷。

[0044] 如本文使用的术语“C<sub>3</sub>-C<sub>n</sub>环烷基羰基”是指附接至羰基(C=O)基团的3元-n元环烷基,该羰基连接至分子的剩余部分。类似地,如本文使用的术语“C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>烷基羰基”、“C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>烷氧基羰基”、“苯基氧基羰基”和“苄基氧基羰基”是指附接至羰基(C=O)基团的烷基、烷氧基、苯基氧基和苄基氧基,该羰基连接至分子的剩余部分。

[0045] 如本文使用的术语“C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>环烷基C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基”是指带有亚甲基或亚乙基的3元或4元环烷基,该亚甲基或亚乙基连接至分子的剩余部分。在这种情况下,C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>环烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基是取代的,一个或多个取代基可以在环烷基和/或烷基上。

[0046] 如本文使用的术语“C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基”是指连接至1元至4元卤代烷氧基的3元至6元环烷基,该卤代烷氧基连接至分子的剩余部分。

[0047] 如本文使用的术语“氨基羰基C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>烷基”是指烷基,其中基团中的氢原子之一被CONH<sub>2</sub>基团替代。

[0048] 如本文使用的术语“羟基羰基C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>烷基”是指烷基,其中基团中的氢原子之一被COOH基团替代。

[0049] 如本文使用的术语“C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>烷基硫烷基”是指通过硫原子连接的C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>烷基部分。类似地,如本文使用的术语“C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>卤代烷基硫基”或“C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>卤代烷基硫烷基”是指通过硫原子连接的C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>卤代烷基部分。类似地,术语“C<sub>3</sub>-C<sub>n</sub>环烷基硫烷基”是指通过硫原子连接的3元-n元环烷基部分。

[0050] 如本文使用的术语“C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>烷基亚磺酰基”是指通过S(=O)基团的硫原子连接的C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>烷基部分。类似地,如本文使用的术语“C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>卤代烷基亚磺酰基”是指通过S(=O)基团的硫原子连接的C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>卤代烷基部分。类似地,术语“C<sub>3</sub>-C<sub>n</sub>环烷基亚磺酰基”是指通过S(=O)基团的硫原子连接的3元-n元环烷基部分。

[0051] 如本文使用的术语“C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>烷基磺酰基”是指通过S(=O)<sub>2</sub>基团的硫原子连接的C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>烷基部分。类似地,如本文使用的术语“C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>卤代烷基磺酰基”是指通过S(=O)<sub>2</sub>基团的硫原子连接的C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>卤代烷基部分。类似地,术语“C<sub>3</sub>-C<sub>n</sub>环烷基磺酰基”是指通过S(=O)<sub>2</sub>基团的硫原子连接的3元-n元环烷基部分。

[0052] 如本文使用的术语“三甲基硅烷C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>烷基”是指烷基,其中基团中的氢原子之一被-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>基团替代。

[0053] 如本文使用的术语“C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub>烯基”是指具有从两个至n个碳原子和一个或两个双键的直链或支链烯基链,例如乙烯基、丙-1-烯基、丁-2-烯基。

[0054] 如本文使用的术语“C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub>卤代烯基”是指被一个或多个可以相同或不同的卤原子取代的C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub>烯基部分。

[0055] 如本文使用的术语“C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub>炔基”是指具有从二至n个碳原子和一个三键的直链或支链炔基链,例如乙炔基、丙-2-炔基、丁-3-炔基。

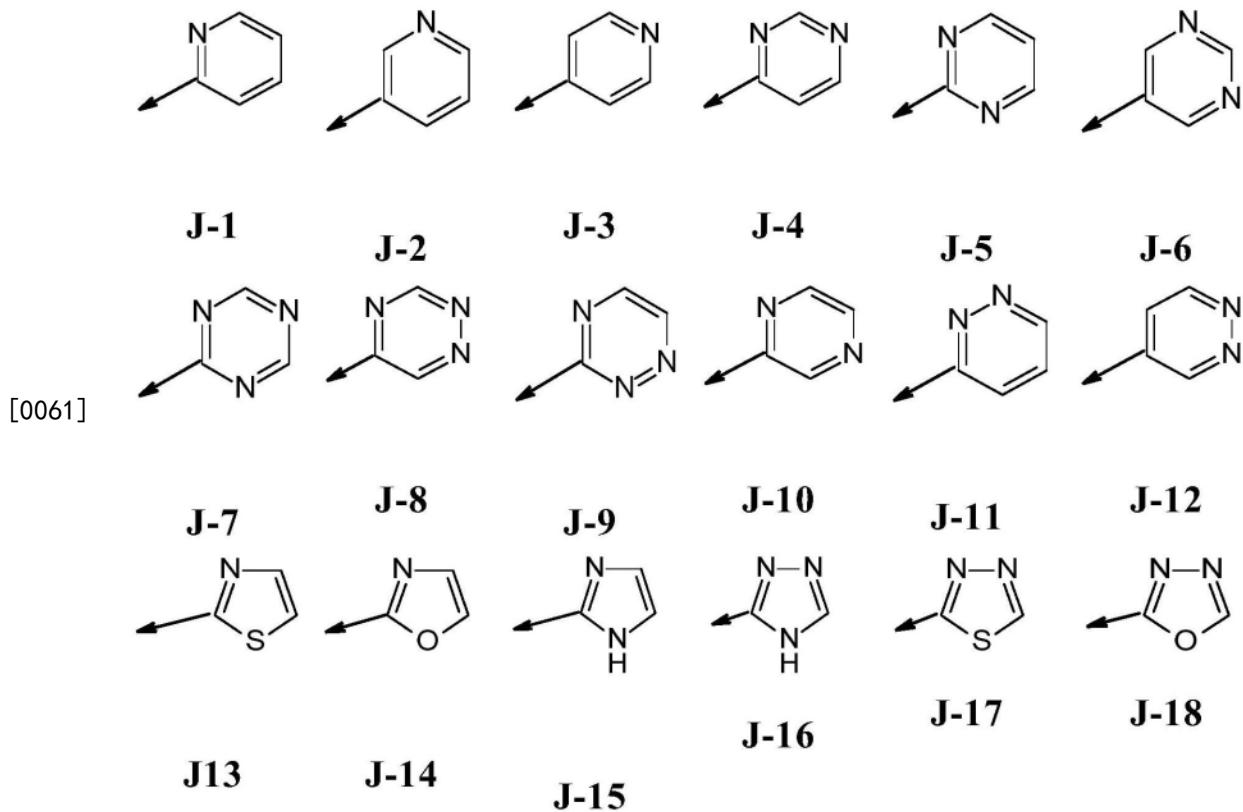
[0056] 如本文使用的术语“C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub>卤代炔基”是指被一个或多个可以相同或不同的卤原子取代的C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub>炔基部分。

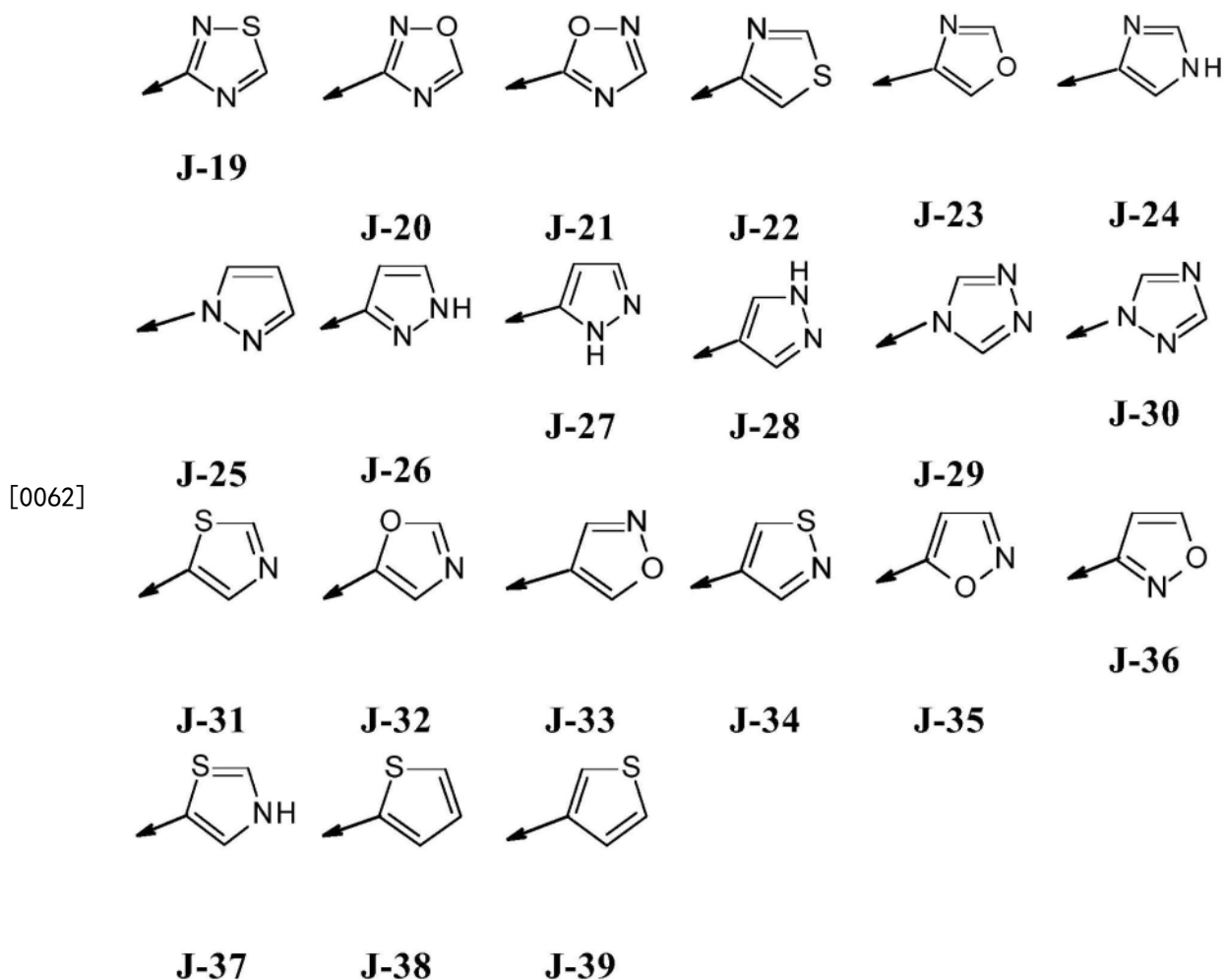
[0057] 卤素或“卤代(halo)”通常是氟、氯、溴或碘。这也相应地适用于与其他含义组合的卤素,如卤代烷基。

[0058] 如本文使用的术语“杂芳基”是指具有1至3个独立地选自N、O和S的杂原子的5元或6元芳香族单环。实例是下面的方案J中所示的杂芳基J-1至J-39。优选的杂芳基是吡啶基、嘧啶基、和吡唑基。

[0059] 表J:杂芳基J-1至J-39:

[0060] 杂芳基J-1至J-39中的箭头表示与化合物的剩余部分的附接点。





[0063] 如本文使用的术语“任选地被取代的”意指所引用的基团未被取代或被指定的取代基取代,例如,“C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>环烷基任选地被1或2个卤素原子取代”意指C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>环烷基、被1个卤素原子取代的C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>环烷基和被2个卤素原子取代的C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>环烷基。

[0064] 如本文例如在Q<sup>a</sup>、Q<sup>b</sup>、R<sup>4a</sup>、R<sup>4b</sup>、和T中所使用的交错线表示与化合物的剩余部分的连接/附接点。

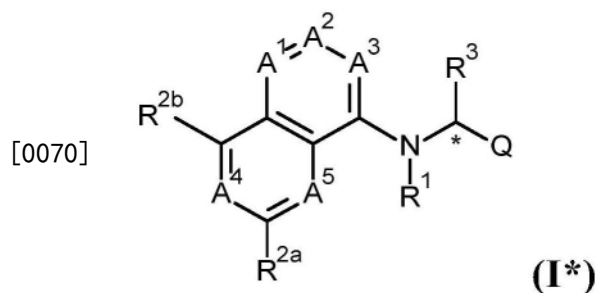
[0065] 如本文所使用的术语“控制”是指减少有害生物的数量、消除有害生物和/或预防进一步的有害生物损害,使得减少对植物或对植物衍生产品的损害。

[0066] 如本文所使用的术语“有害生物”是指在农业、园艺、林业、植物来源的产品(如果实、谷物和木材)的储存中存在的昆虫和软体动物;以及那些与人造结构的损坏相关的有害生物。术语有害生物涵盖有害生物生命周期的所有阶段。

[0067] 如本文所使用的术语“有效量”是指化合物或其盐的量,该量在单次或多次施用时提供希望的效果。

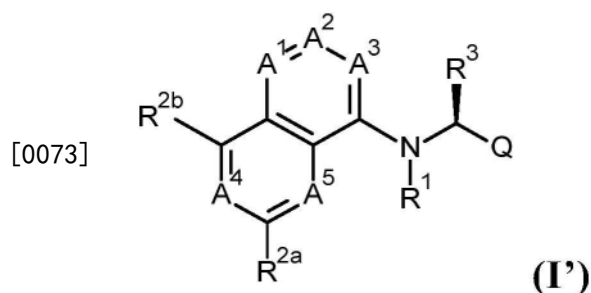
[0068] 有效量由本领域技术人员通过使用已知技术和通过观察在类似情况下获得的结果来容易地确定。在确定有效量时,考虑了许多因素,包括但不限于:要施用的植物或衍生产品的类型;要控制的有害生物及其生命周期;所施用的特定化合物;施用类型;以及其他相关情况。

[0069] 如本领域的普通技术人员将理解的,具有式(I)的化合物含有立体中心,该立体中心在以下式(I\*)中用星号指示:



[0071] 其中 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $A^5$ 、 $Q$ 、 $R^1$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ 和 $R^3$ 是如第一方面中所定义的。

[0072] 本发明考虑了外消旋体和单独的对映异构体两者。具有优选立体化学的化合物在下面列出。本发明的特别优选的化合物是具有式(I')的化合物：



[0074] 其中 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $A^5$ 、 $Q$ 、 $R^1$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ 和 $R^3$ 是如第一方面中所定义的，以及该具有式(I')的化合物的立体异构体、对映异构体和互变异构体以及其N-氧化物和农用化学上可接受的盐。

[0075] 提供了根据本发明的实施例，如下面列出的。

[0076] 在本发明的每个方面的实施例中， $A^1$ 、 $A^2$ 和 $A^3$ 定义如下：

[0077] A.  $A^1$ 、 $A^2$ 和 $A^3$ 彼此独立地是N或 $CR^Y$ ；或 $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NR-C(=X^0)-N$ ；其中 $X^0$ 是O或S；

[0078] B.  $A^1$ 、 $A^2$ 和 $A^3$ 彼此独立地是N或 $CR^Y$ ，其前提是三个中不超过两个是N；或 $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NR-C(=X^0)-N$ ；或者

[0079] C.  $A^1$ 和 $A^3$ 是N并且 $A^2$ 是 $CR^Y$ ；或 $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NR-C(=O)-N$ ；或者

[0080] D.  $A^1$ 、 $A^2$ 和 $A^3$ 彼此独立地是N或CH；或 $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NR-C(=O)-N$ ；或者

[0081] E.  $A^1$ 、 $A^2$ 和 $A^3$ 彼此独立地是N或CH，其前提是三个中不超过两个是N；或 $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NH-C(=O)-N$ ；或者

[0082] F.  $A^1$ 是N，且 $A^2$ 和 $A^3$ 是CH；或 $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NH-C(=O)-N$ ；或者

[0083] G.  $A^1$ 和 $A^2$ 是CH，并且 $A^3$ 是N；或 $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NR-C(=O)-N$ ；或者

[0084] H.  $A^1$ 和 $A^3$ 是N，且 $A^2$ 是CH；或 $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NH-C(=O)-N$ ；或者

[0085] I.  $A^1$ 、 $A^2$ 和 $A^3$ 彼此独立地是N或 $CR^Y$ ，其前提是三个中不超过两个是N；或者

[0086] J.  $A^1$ 和 $A^3$ 是N并且 $A^2$ 是 $CR^Y$ ；或者

[0087] K.  $A^1$ 、 $A^2$ 和 $A^3$ 彼此独立地是N或CH；或者

[0088] L.  $A^1$ 、 $A^2$ 和 $A^3$ 彼此独立地是N或CH，其前提是三个中不超过两个是N；或者

[0089] M.  $A^1$ 是N，且 $A^2$ 和 $A^3$ 是CH；或者

[0090] N.  $A^1$ 和 $A^2$ 是CH，并且 $A^3$ 是N；或者

[0091] O.  $A^1$ 和 $A^3$ 是N，且 $A^2$ 是CH；或者

- [0092] P.  $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NR-C(=X^0)-N$ ;或者
- [0093] Q.  $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $N(CH_3)-C(=X^0)-N$ ;或者
- [0094] R.  $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NH-C(=X^0)-N$ ;或者
- [0095] S.  $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NR-C(=O)-N$ ;或者
- [0096] T.  $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $N(CH_3)-C(=O)-N$ ;或者
- [0097] U.  $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NH-C(=O)-N$ ;或者
- [0098] V.  $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NR-C(=S)-N$ ;或者
- [0099] W.  $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NH-C(=S)-N$ ;或者
- [0100] X.  $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $N(CH_3)-C(=S)-N$ 。
- [0101] 在本发明的每个方面的实施例中,
- [0102] A.  $X^0$ 是O或S;或者
- [0103] B.  $X^0$ 是O;或者
- [0104] C.  $X^0$ 是S。
- [0105] 在本发明的每个方面的实施例中,
- [0106] A.  $A^4$ 是 $CR^Y$ ,且 $A^5$ 是N;或者
- [0107] B.  $A^4$ 是 $CR^Y$ ,且 $A^5$ 是CH;或者
- [0108] C.  $A^4$ 是CH,且 $A^5$ 是N;或者
- [0109] D.  $A^4$ 是N,且 $A^5$ 是CH;或者
- [0110] E.  $A^4$ 和 $A^5$ 都是CH。
- [0111] 在本发明的每个方面的实施例中,
- [0112] A.  $A^1$ 是N, $A^2$ 和 $A^3$ 是CH,且 $A^4$ 和 $A^5$ 都是CH;或者
- [0113] B.  $A^1$ 和 $A^2$ 是CH, $A^3$ 是N,且 $A^4$ 和 $A^5$ 都是CH;或者
- [0114] C.  $A^1$ 和 $A^3$ 是N, $A^2$ 是CH,且 $A^4$ 是 $CR^Y$ 且 $A^5$ 是CH;或者
- [0115] D.  $A^1$ 和 $A^3$ 是N, $A^2$ 是CH,且 $A^4$ 是CH且 $A^5$ 是N;或者
- [0116] E.  $A^1$ 和 $A^3$ 是N, $A^2$ 是CH,且 $A^4$ 是N且 $A^5$ 是CH;或者
- [0117] F.  $A^1$ 和 $A^3$ 是N, $A^2$ 是CH,且 $A^4$ 是N或CH且 $A^5$ 是CH;或者
- [0118] G.  $A^1$ 和 $A^3$ 是N, $A^2$ 是CH,且 $A^4$ 是CH且 $A^5$ 是N或CH;或者
- [0119] H.  $A^1$ 和 $A^3$ 是N, $A^2$ 是CH,且 $A^4$ 和 $A^5$ 都是N;或者
- [0120] I.  $A^1$ 和 $A^3$ 是N, $A^2$ 是CH,且 $A^4$ 和 $A^5$ 都是CH;或者
- [0121] J.  $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NR-C(=O)-N$ 并且 $A^4$ 和 $A^5$ 都是CH;或者
- [0122] K.  $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $N(CH_3)-C(=O)-N$ 并且 $A^4$ 和 $A^5$ 都是CH;或者
- [0123] L.  $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NH-C(=O)-N$ 并且 $A^4$ 和 $A^5$ 都是CH。
- [0124] 在本发明的每个方面的实施例中,R是
- [0125] A. 氢、 $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基或 $C_1-C_3$ 卤代烷氧基;或者
- [0126] B. 氢、甲基、乙基、二氟乙基或三氟乙基;或者
- [0127] C. 氢;甲基、乙基、2,2-二氟乙基或2,2,2-三氟乙基,或者
- [0128] D. 氢;或者
- [0129] E. 甲基或2,2,2-三氟乙基;或者
- [0130] F. 甲基;或者

[0131] G. 甲基或氢。

[0132] 在本发明的每个方面的实施例中,  $R^1$  是

[0133] A. 氢,  $C_1$ - $C_6$ 烷基,  $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基, 氨基羰基 $C_1$ - $C_6$ 烷基, 羟基羰基 $C_1$ - $C_6$ 烷基,  $C_1$ - $C_6$ 硝基烷基, 三甲基硅烷 $C_1$ - $C_6$ 烷基,  $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基,  $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基,  $C_2$ - $C_6$ 烯基,  $C_2$ - $C_6$ 卤代烯基,  $C_2$ - $C_6$ 炔基,  $C_2$ - $C_6$ 卤代炔基,  $C_3$ - $C_4$ 环烷基 $C_1$ - $C_2$ 烷基-, 或其中 $C_3$ - $C_4$ 环烷基被1或2个卤素原子取代的 $C_3$ - $C_4$ 环烷基 $C_1$ - $C_2$ 烷基-, 氧杂环丁烷-3-基- $CH_2$ -,  $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基,  $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基, 苯基氧基羰基, 苄基氧基羰基, 苄基或被1至3个独立地选自卤素、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基和 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基的取代基取代的苄基; 或者

[0134] B. 氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基、氨基羰基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、羟基羰基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 硝基烷基、三甲基硅烷 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_2$ - $C_6$ 卤代烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、 $C_2$ - $C_6$ 卤代炔基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基 $C_1$ - $C_2$ 烷基-、其中 $C_3$ - $C_4$ 环烷基被1或2个卤素原子取代的 $C_3$ - $C_4$ 环烷基 $C_1$ - $C_2$ 烷基-、氧杂环丁烷-3-基- $CH_2$ -、苯基氧基羰基、苄基氧基羰基、或苄基; 或者

[0135] C. 氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基、氨基羰基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、羟基羰基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 硝基烷基、三甲基硅烷 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_2$ - $C_6$ 卤代烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、 $C_2$ - $C_6$ 卤代炔基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基 $C_1$ - $C_2$ 烷基-、苄基氧基羰基、或苄基; 或者

[0136] D. 氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基、氨基羰基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、羟基羰基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_2$ - $C_6$ 卤代烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、 $C_2$ - $C_6$ 卤代炔基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基 $C_1$ - $C_2$ 烷基-、苄基氧基羰基、或苄基; 或者

[0137] E. 氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 氰基烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_2$ - $C_6$ 卤代烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、 $C_2$ - $C_6$ 卤代炔基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基 $C_1$ - $C_2$ 烷基-、苄基氧基羰基、或苄基; 或者

[0138] F. 氢、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 氰基烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_2$ - $C_4$ 烯基、 $C_2$ - $C_4$ 卤代烯基、 $C_2$ - $C_4$ 炔基、 $C_2$ - $C_4$ 卤代炔基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基 $C_1$ - $C_2$ 烷基-、苄基氧基羰基、或苄基; 或者

[0139] G. 氢、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 氰基烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_2$ - $C_4$ 烯基、 $C_2$ - $C_4$ 卤代烯基、 $C_2$ - $C_4$ 炔基、 $C_2$ - $C_4$ 卤代炔基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基 $C_1$ - $C_2$ 烷基-、苄基氧基羰基、或苄基; 或者

[0140] H. 氢、甲基、乙基、氰基甲基、甲氧基甲基、环丙基-甲基、烯丙基、炔丙基、苄基氧基羰基、或苄基; 或者

[0141] I. 氢、甲基、或环丙基-甲基; 或者

[0142] J. 氢、或甲基; 或者

[0143] K. 氢。

[0144] 在本发明的每个方面的实施例中,  $R^{2a}$  是

[0145] A. 氢、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基硫烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基、卤素、 $NO_2$ 、 $SF_5$ 、 $CN$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)OH$ 、 $C(S)NH_2$ 、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基、被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基羰基、苯基、被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的苯基、杂芳基、被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的杂芳基、 $OR^6$ 、哌啶-2-酮-1-基、被一至两个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的哌啶-2-酮-1-基、吡啶-2-酮-1-基、被一至两个

独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的吡啶-2-酮-1-基、氮杂环丁烷-1-基、被一至两个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的氮杂环丁烷-1-基、吡咯烷-1-基、被一至两个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的吡咯烷-1-基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_4$ 烷基、被一至两个独立地选自 $R^z$ 的取代基取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、被一至两个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_5$ 氰基烷基、 $C_1$ - $C_5$ 氰基烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基硫烷基、被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷基硫烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基、被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基、和被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基；或者

[0146] B. 卤素、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基、苯基、选自J-1至J-39的杂芳基( $C_3$ - $C_4$ 环烷基、苯基或杂芳基中的每一个彼此独立地被一至三个取代基 $R^x$ 取代)、 $OR^6$ 、哌啶-2-酮-1-基、吡啶-2-酮-1-基、任选地被 $R^x$ 取代的氮杂环丁烷-1-基、吡咯烷-1-基、任选地被 $R^x$ 取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_4$ 烷基、任选地被 $R^x$ 取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_5$ 氰基烷基、 $C_1$ - $C_5$ 氰基烷氧基、任选地被 $R^x$ 取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基、或任选地被 $R^x$ 取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基；或者

[0147] C. 卤素、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基、苯基、选自J-1和J-25的杂芳基( $C_3$ - $C_4$ 环烷基、苯基或杂芳基中的每一个彼此独立地被一至三个取代基 $R^x$ 取代)、 $OR^6$ 、哌啶-2-酮-1-基、吡啶-2-酮-1-基、任选地被 $R^x$ 取代的氮杂环丁烷-1-基、吡咯烷-1-基、任选地被 $R^x$ 取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_4$ 烷基、任选地被 $R^x$ 取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_5$ 氰基烷基、 $C_1$ - $C_5$ 氰基烷氧基、任选地被 $R^x$ 取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基、或任选地被 $R^x$ 取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基；或者

[0148] D. 卤素、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基、苯基、吡唑基( $C_3$ - $C_4$ 环烷基、苯基、吡唑基中的每一个彼此独立地被一至三个取代基 $R^x$ 取代)、 $OR^6$ 、哌啶-2-酮-1-基、吡啶-2-酮-1-基、任选地被 $R^x$ 取代的氮杂环丁烷-1-基、吡咯烷-1-基、任选地被 $R^x$ 取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_4$ 烷基、任选地被 $R^x$ 取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_5$ 氰基烷基、 $C_1$ - $C_5$ 氰基烷氧基、任选地被 $R^x$ 取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基、或任选地被 $R^x$ 取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基；或者

[0149] E. 卤素、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基、苯基或吡唑基( $C_3$ - $C_4$ 环烷基、苯基、吡唑基中的每一个彼此独立地被一至两个取代基 $R^x$ 取代)、 $OR^6$ 、任选地被 $R^x$ 取代的氮杂环丁烷-1-基、任选地被 $R^x$ 取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_4$ 烷基、任选地被 $R^x$ 取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、任选地被 $R^x$ 取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基、或任选地被 $R^x$ 取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基；或者

[0150] F. 卤素、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基、被一至两个取代基 $R^x$ 取代的 $C_3$ - $C_4$ 环烷基、 $OR^6$ 、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_4$ 烷基、被 $R^x$ 取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基、被 $R^x$ 取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基、或被 $R^x$ 取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基；或者

[0151] G. 卤素、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基、被一至两个卤素、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、或 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基取代的 $C_3$ - $C_4$ 环烷基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基甲基、被一至两个卤素、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、或 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基取代的 $C_3$ - $C_4$ 环烷基甲基、或被一至三个卤素取代的 $C_1$ - $C_2$ 烷基磺酰基；或者

[0152] H. 卤素、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、环丙基、被一至两个卤素、甲基、或三氟甲基取代的环丙基、被一至两个卤素或三氟甲基取代的环丙基甲基、或被一至三个卤素取代的 $C_1$ - $C_2$ 烷基磺酰基；或者

[0153] I. 卤素,  $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基, 被一至两个氟、甲基、或三氟甲基取代的环丙基, 氰基, 被一至两个氟取代的环丙基甲基, 或三氟甲基磺酰基; 或者

[0154] J. 卤素,  $C_1$ - $C_3$ 烷基,  $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基,  $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基硫基,  $C_1$ - $C_3$ 烷氧基,  $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基, CN,  $C_3$ - $C_6$ 环烷基, 被一至三个独立地选自 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、氰基和卤素的取代基取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基,  $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_4$ 烷基, 被一至五个独立地选自 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、氰基和卤素的取代基取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_4$ 烷基,  $C_1$ - $C_5$ 氰基烷基,  $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基,  $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基磺酰基,  $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基,  $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基亚磺酰基,  $C_3$ - $C_6$ 环烷基硫烷基,  $C_3$ - $C_6$ 环烷基亚磺酰基或 $C_3$ - $C_6$ 环烷基磺酰基; 或者

[0155] K. 卤素,  $C_1$ - $C_3$ 烷基,  $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基,  $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基硫基,  $C_1$ - $C_3$ 烷氧基,  $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基, CN,  $C_3$ - $C_6$ 环烷基, 被一或两个独立地选自 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、氰基和卤素的取代基取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基,  $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_4$ 烷基, 被一至三个独立地选自 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、氰基和卤素的取代基取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_4$ 烷基,  $C_1$ - $C_5$ 氰基烷基,  $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基,  $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基磺酰基,  $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基,  $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基亚磺酰基,  $C_3$ - $C_6$ 环烷基硫烷基,  $C_3$ - $C_6$ 环烷基亚磺酰基或 $C_3$ - $C_6$ 环烷基磺酰基; 或者

[0156] L. 卤素,  $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基,  $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基硫基,  $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基,  $C_3$ - $C_6$ 环烷基, 被一或两个独立地选自 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、氰基和卤素的取代基取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基,  $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_4$ 烷基, 被一至三个独立地选自 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、氰基和卤素的取代基取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_4$ 烷基,  $C_1$ - $C_5$ 氰基烷基,  $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基,  $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基磺酰基,  $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基,  $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基亚磺酰基,  $C_3$ - $C_6$ 环烷基硫烷基,  $C_3$ - $C_6$ 环烷基亚磺酰基或 $C_3$ - $C_6$ 环烷基磺酰基; 或者

[0157] M. 卤素或 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基; 或者

[0158] N. 氯、氟、溴、二氟甲基或三氟甲基; 或者

[0159] O. 氟、氯、溴、或三氟甲基; 或者

[0160] P. 三氟甲基; 或者

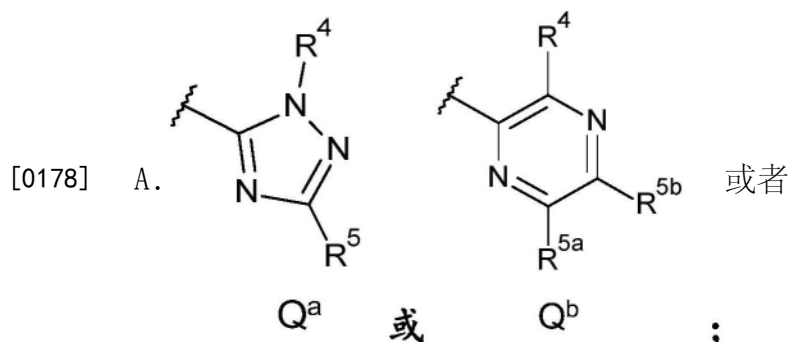
[0161] Q. 氯或三氟甲基;

[0162] R. 氯、溴、碘、或三氟甲基。

[0163] 在本发明的每个方面的实施例中,  $R^{2b}$ 是

[0164] A. 氢、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基硫烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基、卤素、 $NO_2$ 、 $SF_5$ 、CN、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)OH$ 、 $C(S)NH_2$ 、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基、被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基羰基、苯基、被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的苯基、杂芳基、被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的杂芳基、 $OR^6$ 、哌啶-2-酮-1-基、被一至两个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的哌啶-2-酮-1-基、吡啶-2-酮-1-基、被一至两个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的吡啶-2-酮-1-基、氮杂环丁烷-1-基、被一至两个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的氮杂环丁烷-1-基、吡咯烷-1-基、被一至两个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的吡咯烷-1-基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_4$ 烷基、被一至两个独立地选自 $R^z$ 的取代基取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、被一至两个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的 $C_3$ - $C_6$ 环烷基 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_5$ 氰基烷基、 $C_1$ - $C_5$ 氰基烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基硫烷基、被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷基硫烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基、被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基、和被一至三个独立地选自 $R^x$ 的取代基取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基; 或者

- [0165] B. 卤素、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷硫基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基、或CN；或者
- [0166] C. 卤素、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、或 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基；或者
- [0167] D. 卤素或 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基；或者
- [0168] E. 氯、氟、溴、二氟甲基或三氟甲基；或者
- [0169] F. 氟、氯、溴、或三氟甲基；或者
- [0170] G. 三氟甲基；或者
- [0171] H. 氯或三氟甲基；或者
- [0172] I. 氯、溴、碘、或三氟甲基。
- [0173] 在本发明的每个方面的实施例中， $R^3$ 是
- [0174] A.  $C_1$ - $C_3$ 烷基或 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基；或者
- [0175] B. 甲基或三氟甲基；或者
- [0176] C. 甲基。
- [0177] 在本发明的每个方面的实施例中，Q是



- [0179] B.  $Q^a$ ，其中 $R^4$ 是 $R^{4a}$ 或 $R^{4b}$ ；或者
- [0180] C.  $Q^a$ ，其中 $R^4$ 是 $R^{4a}$ ；或者
- [0181] D.  $Q^a$ ，其中 $R^4$ 是 $R^{4b}$ ；或者
- [0182] E.  $Q^b$ ，其中 $R^4$ 是 $R^{4a}$ 或 $R^{4b}$ ；或者
- [0183] F.  $Q^b$ ，其中 $R^4$ 是 $R^{4a}$ ；或者
- [0184] G.  $Q^b$ ，其中 $R^4$ 是 $R^{4b}$ 。
- [0185] 在本发明的每个方面的实施例中， $Q^a$ 是
- [0186] A. 选自 $Q^A$ -1至 $Q^A$ -16；或者
- [0187] B. 选自 $Q^A$ -1、 $Q^A$ -6、 $Q^A$ -7、 $Q^A$ -10和 $Q^A$ -15；或者
- [0188] C.  $Q^A$ -1或 $Q^A$ -15；或者
- [0189] D. 选自 $Q^A$ -1至 $Q^A$ -16，其中 $R^4$ 是 $R^{4a}$ ；或者
- [0190] E. 选自 $Q^A$ -1至 $Q^A$ -16，其中 $R^4$ 是 $R^{4b}$ ；或者
- [0191] F. 选自 $Q^A$ -1、 $Q^A$ -6、 $Q^A$ -7、 $Q^A$ -10和 $Q^A$ -15；其中 $R^4$ 是 $R^{4a}$ ；或者
- [0192] G. 选自 $Q^A$ -1、 $Q^A$ -6、 $Q^A$ -7、 $Q^A$ -10和 $Q^A$ -15；其中 $R^4$ 是 $R^{4b}$ ；或者
- [0193] H.  $Q^A$ -1或 $Q^A$ -15，其中 $R^4$ 是 $R^{4a}$ ；或者
- [0194] I.  $Q^A$ -1或 $Q^A$ -15，其中 $R^4$ 是 $R^{4b}$ ；或者
- [0195] J.  $Q^A$ -1并且 $R^4$ 是 $R^{4a}$ 或 $R^{4b}$ ，

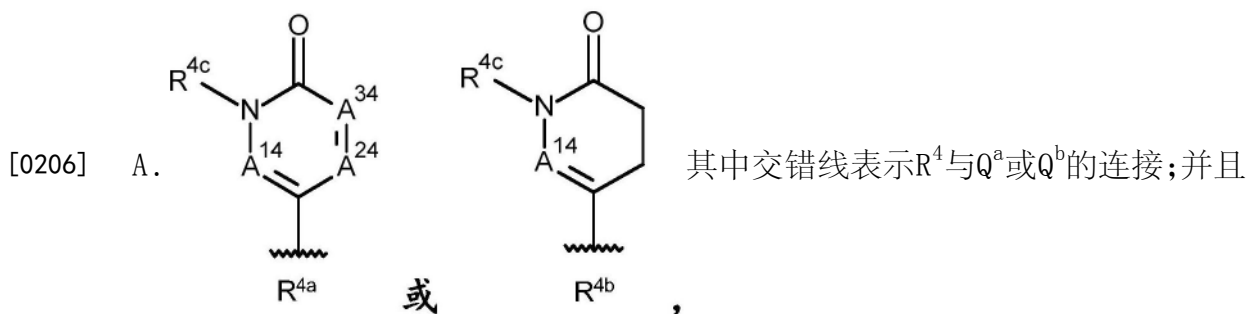
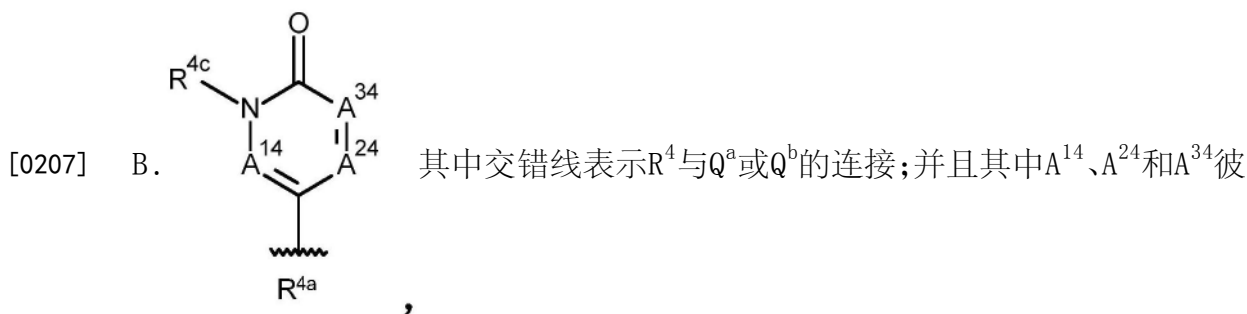
[0196]

|                                |                                |                                |                                |
|--------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|
| <p><b>Q<sup>A</sup>-1</b></p>  | <p><b>Q<sup>a</sup>-2</b></p>  | <p><b>Q<sup>a</sup>-3</b></p>  | <p><b>Q<sup>a</sup>-4</b></p>  |
| <p><b>Q<sup>a</sup>-5</b></p>  | <p><b>Q<sup>a</sup>-6</b></p>  | <p><b>Q<sup>a</sup>-7</b></p>  | <p><b>Q<sup>a</sup>-8</b></p>  |
| <p><b>Q<sup>a</sup>-9</b></p>  | <p><b>Q<sup>A</sup>-10</b></p> | <p><b>Q<sup>A</sup>-11</b></p> | <p><b>Q<sup>A</sup>-12</b></p> |
| <p><b>Q<sup>A</sup>-13</b></p> | <p><b>Q<sup>A</sup>-14</b></p> | <p><b>Q<sup>A</sup>-15</b></p> | <p><b>Q<sup>A</sup>-16</b></p> |

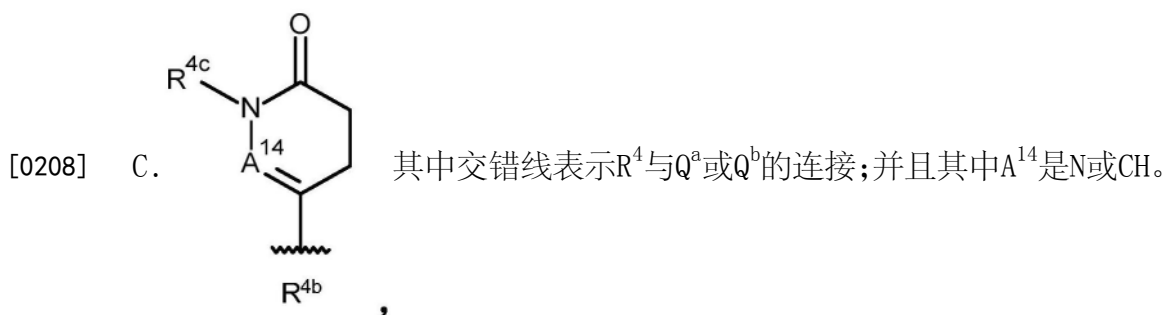
[0197] 在本发明的每个方面的实施例中, Q<sup>b</sup>是[0198] A. 选自Q<sup>B</sup>-1至Q<sup>B</sup>-13; 或者[0199] B. Q<sup>B</sup>-1; 或者[0200] C. 选自Q<sup>B</sup>-1至Q<sup>B</sup>-13, 其中R<sup>4</sup>是R<sup>4a</sup>; 或者[0201] D. 选自Q<sup>B</sup>-1至Q<sup>B</sup>-13, 其中R<sup>4</sup>是R<sup>4b</sup>; 或者[0202] E. Q<sup>B</sup>-1, 并且R<sup>4</sup>是R<sup>4a</sup>; 或者[0203] F. Q<sup>B</sup>-1, 并且R<sup>4</sup>是R<sup>4a</sup>。

[0204]

|                             |                             |                             |                            |                             |
|-----------------------------|-----------------------------|-----------------------------|----------------------------|-----------------------------|
| <b>Q<sup>B</sup>-1</b><br>  | <b>Q<sup>B</sup>-2</b><br>  | <b>Q<sup>B</sup>-3</b><br>  | <b>Q<sup>B</sup>-4</b><br> | <b>Q<sup>B</sup>-5</b><br>  |
| <b>Q<sup>B</sup>-6</b><br>  | <b>Q<sup>B</sup>-7</b><br>  | <b>Q<sup>B</sup>-8</b><br>  | <b>Q<sup>B</sup>-9</b><br> | <b>Q<sup>B</sup>-10</b><br> |
| <b>Q<sup>B</sup>-11</b><br> | <b>Q<sup>B</sup>-12</b><br> | <b>Q<sup>B</sup>-13</b><br> |                            |                             |

[0205] 在本发明的每个方面的实施例中, R<sup>4</sup>是其中A<sup>14</sup>、A<sup>24</sup>和A<sup>34</sup>彼此独立地是N或CH;或者

此独立地是N或CH;或者



[0209] 在本发明的每个方面的实施例中,其中R<sup>4</sup>是R<sup>4a</sup>并且

[0210] A. A<sup>14</sup>、A<sup>24</sup>和A<sup>34</sup>彼此独立地是N或CH,前提是至少一个是N;或者

[0211] B. A<sup>14</sup>、A<sup>24</sup>和A<sup>34</sup>彼此独立地是N或CH,前提是一个是N并且其他两个是CH;或者

[0212] C. A<sup>14</sup>、A<sup>24</sup>和A<sup>34</sup>彼此独立地是N或CH,前提是至少一个是CH;或者

[0213] D. A<sup>14</sup>、A<sup>24</sup>和A<sup>34</sup>彼此独立地是N或CH,前提是一个是CH并且其他两个是N;

[0214] E. A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是N或CH,并且A<sup>34</sup>是N或CH;或者

[0215] F. A<sup>14</sup>是N或CH, A<sup>24</sup>是N,并且A<sup>34</sup>是N或CH;或者

[0216] G. A<sup>14</sup>是N或CH, A<sup>24</sup>是N或CH,并且A<sup>34</sup>是N;或者

[0217] H. A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N或CH,并且A<sup>34</sup>是N或CH;或者

[0218] I. A<sup>14</sup>是N或CH, A<sup>24</sup>是CH,并且A<sup>34</sup>是N或CH;或者

[0219] J. A<sup>14</sup>是N或CH, A<sup>24</sup>是N或CH,并且A<sup>34</sup>是CH;或者

[0220] K. A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是N,并且A<sup>34</sup>是N或CH;或者

[0221] L. A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH,并且A<sup>34</sup>是N或CH;或者

[0222] M. A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N,并且A<sup>34</sup>是N或CH;或者

[0223] N. A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH,并且A<sup>34</sup>是N或CH;或者

[0224] O. A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是N或CH,并且A<sup>34</sup>是N;或者

[0225] P. A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是N或CH,并且A<sup>34</sup>是CH;或者

[0226] Q. A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N或CH,并且A<sup>34</sup>是N;或者

[0227] R. A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N或CH,并且A<sup>34</sup>是CH;或者

[0228] S. A<sup>14</sup>是N或CH, A<sup>24</sup>是N,并且A<sup>34</sup>是N;或者

[0229] T. A<sup>14</sup>是N或CH, A<sup>24</sup>是N,并且A<sup>34</sup>是CH;或者

[0230] U. A<sup>14</sup>是N或CH, A<sup>24</sup>是CH,并且A<sup>34</sup>是N;或者

[0231] V. A<sup>14</sup>是N或CH, A<sup>24</sup>是CH,并且A<sup>34</sup>是CH;或者

[0232] W. A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是N,并且A<sup>34</sup>是N;或者

[0233] X. A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是N,并且A<sup>34</sup>是CH;或者

[0234] Y. A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH,并且A<sup>34</sup>是N;或者

[0235] Z. A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N,并且A<sup>34</sup>是N;或者

[0236] AA. A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH,并且A<sup>34</sup>是CH;或者

[0237] BB. A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N,并且A<sup>34</sup>是CH;或者

[0238] CC. A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH,并且A<sup>34</sup>是N;或者

[0239] DD. A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH,并且A<sup>34</sup>是CH。

[0240] 在本发明的每个方面的实施例中,其中R<sup>4</sup>是R<sup>4b</sup>

[0241] A.  $A^{14}$  是 CH; 或者

[0242] B.  $A^{14}$  是 N。

[0243] 在本发明的每个方面的实施例中,  $R^{4a}$  是氧代-三嗪基部分、或氧代-二嗪基部分或氧代-吡啶基部分。优选地,  $R^{4a}$  是氧代-二嗪基部分。在本发明的每个方面的实施例中,  $R^{4a}$  是氧代吡啶基、氧代嘧啶基、氧代吡嗪基或氧代哒嗪基部分。在本发明的每个方面的实施例中,  $R^{4b}$  是氧代-二氢-吡啶基或氧代-二氢-哒嗪基部分。 $R^{4a}$  和  $R^{4b}$  各自经由相应环上的碳原子连接至化合物的剩余部分(“连接碳原子”)。该连接碳原子和羰基  $C=O$  在氧代吡啶基、氧代嘧啶基、氧代吡嗪基或氧代哒嗪基部分上相对于彼此处于对位。 $R^{4a}$  和  $R^{4b}$  具有相对于羰基  $C=O$  在邻位上的取代的氮原子。所述取代的氮原子被  $R^{4c}$  取代。在本发明的每个方面的实施例中,  $R^{4a}$  是氧代吡啶基部分 ( $A^{14}$ 、 $A^{24}$  和  $A^{34}$  是 CH, 即,  $R^{4a}$  是实施例 DD)。在本发明的每个方面的实施例中,  $R^{4a}$  具有相对于羰基  $C=O$  在第二邻位上的未取代的氮原子。在这种情况下,  $R^{4a}$  是氧代嘧啶基部分 ( $A^{14}$  和  $A^{24}$  是 CH, 并且  $A^{34}$  是 N, 即,  $R^{4a}$  是实施例 CC), 其中羰基  $C=O$  在环的两个氮原子之间。在本发明的每个方面的实施例中,  $R^{4a}$  具有相对于羰基  $C=O$  在间位上的一个未取代的氮原子。在这种情况下,  $R^{4a}$  是氧代吡嗪基部分 ( $A^{14}$  和  $A^{34}$  是 CH,  $A^{24}$  是 N, 即,  $R^{4a}$  是实施例 BB) 或氧代哒嗪基部分 ( $A^{14}$  是 N,  $A^{24}$  和  $A^{34}$  是 CH, 即,  $R^{4a}$  是实施例 AA)。在本发明的每个方面的实施例中,  $R^{4a}$  是氧代哒嗪基部分 ( $A^{14}$  是 N,  $A^{24}$  和  $A^{34}$  是 CH, 即,  $R^{4a}$  是实施例 AA)。在本发明的每个方面的实施例中,  $R^{4b}$  是氧代-二氢-哒嗪基部分 ( $A^{14}$  是 N, 即,  $R^{4b}$  是实施例 A)。在本发明的每个方面的实施例中,  $R^{4b}$  是氧代-二氢-吡啶基部分 ( $A^{14}$  是 CH, 即,  $R^{4b}$  是实施例 A)。

[0244] 在本发明的每个方面的实施例中,  $R^{4c}$  是

[0245] A.  $C_1$ - $C_3$  烷基、 $C_1$ - $C_3$  卤代烷基、烯丙基、炔丙基、或  $C_3$ - $C_6$  环烷基  $C_1$ - $C_4$  烷基; 或者

[0246] B.  $C_1$ - $C_2$  烷基、 $C_1$ - $C_2$  卤代烷基、烯丙基、炔丙基、或  $C_3$ - $C_4$  环烷基  $C_1$ - $C_2$  烷基; 或者

[0247] C. 甲基、乙基、二氟甲基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟甲基、烯丙基、炔丙基、或环丙基甲基; 或者

[0248] D. 甲基、乙基、二氟甲基、2,2-二氟乙基、烯丙基、炔丙基、或环丙基甲基; 或者

[0249] E. 甲基、乙基、烯丙基、炔丙基、或环丙基甲基; 或者

[0250] F. 甲基或乙基; 或者

[0251] G. 甲基或烯丙基; 或者

[0252] H. 甲基或炔丙基; 或者

[0253] I. 甲基或环丙基甲基; 或者

[0254] J. 甲基。

[0255] 在本发明的每个方面的实施例中, 其中 Q 是  $Q^a$ ,  $R^5$  是

[0256] A. 氢、 $C_1$ - $C_3$  烷基、 $C_1$ - $C_3$  卤代烷基、 $C_3$ - $C_4$  环烷基、 $C_1$ - $C_3$  烷氧基、 $C_3$ - $C_4$  烷氧基  $C(O)-$ 、 $(C_1-C_3$  烷氧基) $_2CH-$ 、卤素、 $CN$ 、 $NH_2C(O)$ 、氨基(即  $NH_2$ )、 $(C_1-C_3$  烷基)氨基、二  $(C_1-C_3$  烷基)氨基、羟基、 $C_3$ - $C_4$  卤代环烷基、 $C_3$ - $C_4$  氰基环烷基、 $C_2$ - $C_6$  烯基、 $C_2$ - $C_6$  卤代烯基、 $C_2$ - $C_6$  炔基、 $C_2$ - $C_6$  卤代炔基、 $C_1$ - $C_4$  卤代烷基硫烷基、 $C_1$ - $C_4$  卤代烷基亚磺酰基、 $C_1$ - $C_4$  卤代烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_4$  烷基硫烷基、 $C_1$ - $C_4$  烷基亚磺酰基、 $C_1$ - $C_4$  烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_3$  烷氧基- $C_1$ - $C_3$  烷基、 $C_1$ - $C_3$  烷氧基- $C_1$ - $C_3$  烷基、 $(C_1-C_3$  烷基)磺酰基氨基、 $(C_1-C_3$  烷基)磺酰基  $(C_1-C_3$  烷基)氨基、 $(C_1-C_3$  烷基)  $NHC(O)$ 、 $(C_1-C_3$  烷基) $_2NC(O)$ 、 $(C_1-C_3$  环烷基)  $NHC(O)$ 、 $(C_1-C_3$  环烷基)  $(C_1-C_3$  烷基)  $NC(O)$ 、 $(C_1-C_3$  烷基)  $C(O)$   $(C_1-C_3$  烷基)  $N$ 、 $(C_1-C_3$  烷基)  $C(O)NH$ 、 $(C_1-C_3$  烷基)  $C(O)$ 、 $(C_1-C_3$  烷氧基)  $C(O)$ 、 $HC(O)$ 、

二苯基甲亚胺、 $C_1-C_3$ 卤代烷氧基、苯基、或5元杂芳香族环；或 $R^5$ 是苯基，该苯基被一至三个选自以下的取代基取代： $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基、 $C_3-C_4$ 环烷基、卤素、CN和羟基；或 $R^5$ 是5元杂芳香族环，该5元杂芳香族环被一至三个选自以下的取代基取代： $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基、 $C_3-C_4$ 环烷基、卤素、CN和羟基；或者

[0257] B. 氢、 $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷基、 $C_3-C_4$ 环烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基、卤素、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基、( $C_1-C_3$ 烷基)C(0)、( $C_1-C_3$ 烷氧基)C(0)、HC(0)、 $C_1-C_3$ 卤代烷氧基或5元杂芳香族环，其中该5元杂芳香族环可以任选地被一至三个选自以下的取代基取代： $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基、 $C_3-C_4$ 环烷基、卤素、CN或羟基；或者

[0258] C. 氢、 $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷基、 $C_3-C_4$ 环烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基、卤素、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基、( $C_1-C_3$ 烷基)C(0)、( $C_1-C_3$ 烷氧基)C(0)、HC(0)或 $C_1-C_3$ 卤代烷氧基；或者

[0259] D. 氢、 $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷基、 $C_3-C_4$ 环烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基、卤素、Cl、Br、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基、( $C_1-C_3$ 烷基)C(0)、( $C_1-C_3$ 烷氧基)C(0)、或 $C_1-C_2$ 卤代烷氧基；或者

[0260] E. 氢、 $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基、 $C_3-C_4$ 环烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷氧基、卤素、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基、( $C_1-C_3$ 烷基)C(0)、HC(0)、或( $C_1-C_3$ 烷氧基)C(0)；或者

[0261] F. 氢、 $C_1-C_2$ 烷基、 $C_1-C_2$ 烷氧基、 $C_3-C_4$ 环烷基、 $C_1-C_2$ 卤代烷氧基、卤素、 $C_1-C_2$ 烷氧基- $C_1-C_2$ 烷基、 $C_1-C_2$ 烷氧基- $C_1-C_2$ 烷氧基- $C_1-C_2$ 烷基、( $C_1-C_2$ 烷基)C(0)、HC(0)、或( $C_1-C_2$ 烷氧基)C(0)；或者

[0262] G. 氢、甲基、三氟甲氧基、甲氧基、环丙基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、二氟甲氧基、2,2,2-三氟乙基、氯、溴、甲氧基乙氧基、甲基羰基、或甲氧基羰基；或者

[0263] H. 氢、甲基、三氟甲氧基、甲氧基、环丙基、二氟甲氧基、氯、溴、甲氧基乙氧基、甲基羰基、或甲氧基羰基；或者

[0264] I. 氢、甲基、甲氧基、环丙基、氯、或甲氧基乙氧基；或者

[0265] J. 氢、或甲基；或者

[0266] K. 氢。

[0267] 在本发明的每个方面的实施例中，其中Q是 $Q^b$ ， $R^{5a}$ 是

[0268] A. 氢、卤素、CN、 $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷基、 $C_3-C_4$ 环烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基或 $C_1-C_3$ 卤代烷氧基；或者

[0269] B. 氢、卤素、CN、 $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷基、 $C_3-C_4$ 环烷基或 $C_1-C_3$ 烷氧基；或者

[0270] C. 氢、卤素、CN、 $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷基或 $C_1-C_3$ 烷氧基；或者

[0271] D. 氢、卤素、CN、 $C_1-C_3$ 烷基或 $C_1-C_3$ 烷氧基；或者

[0272] E. 氢或卤素；或者

[0273] F. 氢。

[0274] 在本发明的每个方面的实施例中，其中Q是 $Q^b$ ， $R^{5b}$ 是

[0275] A. 氢、卤素、CN、 $C_1-C_3$ 卤代烷基、 $C_3-C_4$ 环烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基、或 $C_1-C_3$ 卤代烷氧基；或者

[0276] B. 氢、卤素或 $C_1-C_3$ 烷氧基；或者

[0277] C. 氢。

[0278] 在本发明的每个方面的实施例中,  $R^6$  是

[0279] A. 苯基、苄基、杂芳基、或  $C_3$ - $C_6$  环烷基, 其中的每一个彼此独立地任选地被一个选自  $R^x$  的取代基取代; 或者

[0280] B. 苯基、苄基、环丙基或被一个选自  $R^x$  的取代基取代的环丙基。

[0281] 在本发明的每个方面的实施例中,  $R^x$  独立地选自:

[0282] A. 卤素、 $C_1$ - $C_3$  烷基、 $C_1$ - $C_3$  卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$  烷氧基、 $C_1$ - $C_3$  卤代烷氧基、 $NO_2$ 、 $SF_5$ 、CN、 $C(O)NH_2$ 、 $C(S)NH_2$ 、 $C_1$ - $C_4$  卤代烷基硫烷基、 $C_1$ - $C_4$  卤代烷基亚磺酰基、 $C_1$ - $C_4$  卤代烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_4$  烷基硫烷基、 $C_1$ - $C_4$  烷基亚磺酰基和  $C_1$ - $C_4$  烷基磺酰基; 或者

[0283] B. 卤素、 $C_1$ - $C_3$  卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$  烷氧基、 $C_1$ - $C_3$  卤代烷氧基或 CN; 或者

[0284] C. F、Cl、Br、 $OCF_2H$ 、 $OCH_3$  或 CN。

[0285] 在本发明的每个方面的实施例中,  $R^y$  独立地选自

[0286] A. 氢、 $C_1$ - $C_3$  烷基、 $C_1$ - $C_3$  卤代烷基、羟基、 $C_1$ - $C_3$  烷氧基、 $C_1$ - $C_3$  卤代烷氧基、卤素、CN 和环丙基; 或者

[0287] B. 氢、 $C_1$ - $C_3$  烷基、 $C_1$ - $C_3$  卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$  烷氧基、 $C_1$ - $C_3$  卤代烷氧基、卤素、CN 和环丙基; 或者

[0288] C. 氢、 $C_1$ - $C_3$  烷基、 $C_1$ - $C_3$  卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$  烷氧基、 $C_1$ - $C_3$  卤代烷氧基、和环丙基; 或者

[0289] D. 氢、 $C_1$ - $C_3$  烷基、氯、 $C_1$ - $C_3$  卤代烷基和  $C_1$ - $C_3$  烷氧基; 或者

[0290] E. 氢、氯、甲基、三氟甲基和甲氧基; 或者

[0291] F. 氢、氯、甲基; 或者

[0292] G. 氯、氢。

[0293] 在本发明的每个方面的实施例中,  $R^z$  独立地选自:

[0294] A. 氧代基、卤素、 $C_1$ - $C_3$  烷基、 $C_1$ - $C_3$  卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$  烷氧基、 $C_1$ - $C_3$  卤代烷氧基和 CN; 或者

[0295] B. 氧代基、卤素、 $C_1$ - $C_3$  卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$  烷氧基、 $C_1$ - $C_3$  卤代烷氧基或 CN; 或者

[0296] C. 氧代基、F、Cl、Br、 $OCF_2H$ 、 $OCH_3$  或 CN。

[0297] 因此, 本发明使得可获得一种具有式 (I) 的化合物, 其具有如上所定义的呈所有组合/每种排列的取代基  $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $A^5$ 、 $X^0$ 、 $Q^a$ 、 $Q^b$ 、 $R$ 、 $R^1$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ 、 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5a}$ 、 $R^{5b}$ 、 $R^6$ 、 $R^x$ 、 $R^y$  和  $R^z$ 。

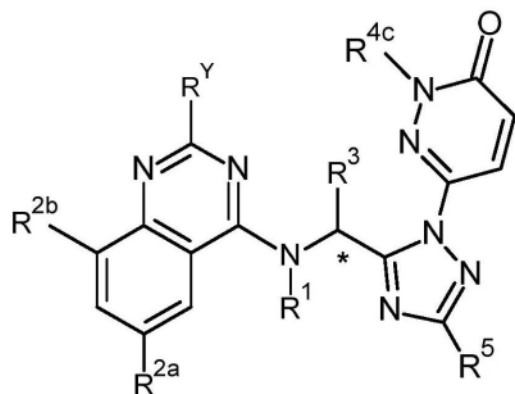
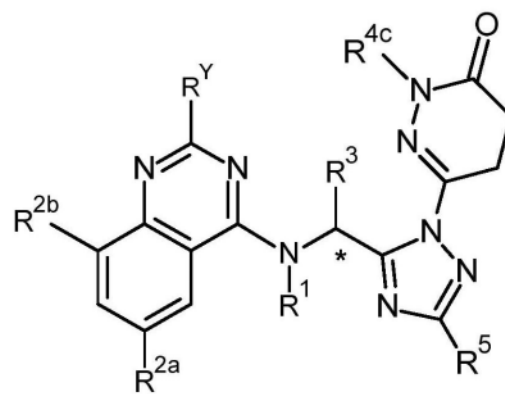
[0298] 因此, 使得可获得具有式 (I) 的化合物, 例如, 其中  $A^1$ 、 $A^2$  和  $A^3$  是实施例 S (即,  $A^1=A^2=A^3$  一起是  $NR-C(=O)-N$ ),  $A^4$  和  $A^5$  是实施例 E (即,  $A^4$  和  $A^5$  都是 CH),  $R$  是实施例 B (即,  $R$  是氢、甲基、乙基、二氟乙基或三氟乙基),  $R^1$  是实施例 I (即,  $R^1$  是氢、甲基、或环丙基-甲基),  $R^{2a}$  是实施例 M (即,  $R^{2a}$  是卤素或  $C_1$ - $C_3$  卤代烷基), 如  $R^{2a}$  是实施例 O (即,  $R^{2a}$  是氟、氯、溴、或三氟甲基),  $R^{2b}$  是实施例 E (即,  $R^{2b}$  是氯、氟、溴、二氟甲基、或三氟甲基),  $R^3$  是实施例 B (即,  $R^3$  是甲基或三氟甲基),  $Q$  是实施例 C (即,  $Q$  是  $Q^a$ , 其中  $R^4$  是  $R^{4a}$ ), 其中  $Q^a$  是实施例 H (即,  $Q^a$  是  $Q^A-1$  或  $Q^A-15$ ),  $R^{4a}$  是实施例 I (即,  $A^{14}$  是 N 或 CH,  $A^{24}$  是 CH, 并且  $A^{34}$  是 N 或 CH),  $R^{4c}$  是实施例 G (即,  $R^{4c}$  是甲基或烯丙基)。

[0299] 还使得可获得具有式 (I) 的化合物, 例如, 其中  $A^1$ 、 $A^2$  和  $A^3$  是实施例 J (即,  $A^1$  和  $A^3$  是 N, 并且  $A^2$  是  $CR^y$ ), 其中  $R^y$  是实施例 F (即,  $R^y$  是氢、氯、甲基),  $A^4$  和  $A^5$  是实施例 E (即,  $A^4$  和  $A^5$  都是 CH),  $R^1$  是实施例 F (即,  $R^1$  是氢、 $C_1$ - $C_3$  烷基、 $C_1$ - $C_3$  氰基烷基、 $C_1$ - $C_3$  烷氧基- $C_1$ - $C_3$  烷基、 $C_1$ - $C_3$  卤代

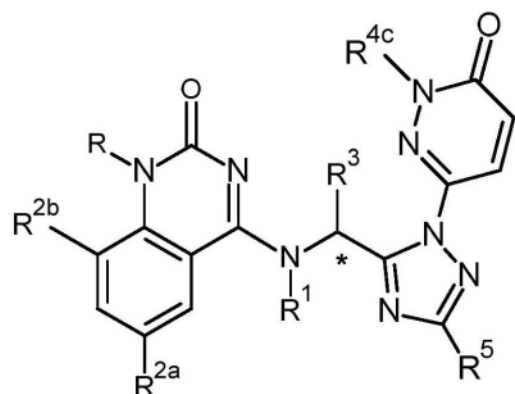
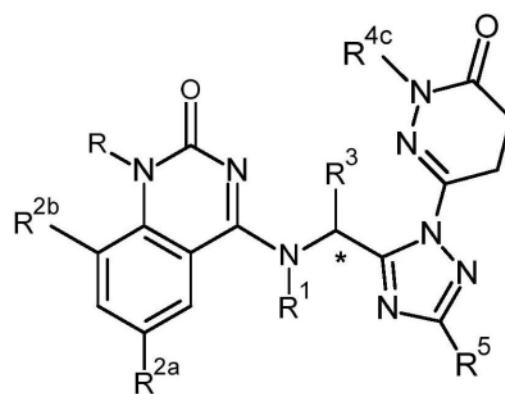
烷基、 $C_2-C_4$ 烯基、 $C_2-C_4$ 卤代烯基、 $C_2-C_4$ 炔基、 $C_2-C_4$ 卤代炔基、 $C_3-C_4$ 环烷基、 $C_1-C_2$ 烷基-、苄基氧基羰基、或苄基), 如 $R^{2a}$ 是实施例M(即, $R^{2a}$ 是卤素或 $C_1-C_3$ 卤代烷基),  $R^{2b}$ 是实施例C(即, $R^{2b}$ 是卤素、 $C_1-C_3$ 卤代烷基、或 $C_1-C_3$ 卤代烷氧基),  $R^3$ 是实施例C(即, $R^3$ 是甲基),  $Q$ 是实施例C(即, $Q$ 是 $Q^a$ , 其中 $R^4$ 是 $R^{4a}$ ), 其中 $Q^a$ 是 $Q^A-1$ ,  $R^{4a}$ 是实施例AA(即, $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是CH, 并且 $A^{34}$ 是CH),  $R^{4c}$ 是实施例I(即, $R^{4c}$ 是甲基或环丙基甲基)。

[0300] 还使得可获得具有式(I)的化合物, 例如, 其中 $A^1$ 、 $A^2$ 和 $A^3$ 是实施例C(即, $A^1$ 和 $A^3$ 是N, 并且 $A^2$ 是 $CR^Y$ ; 或者 $A^1=A^2-A^3$ 一起是 $NR-C(=O)-N$ ), 其中 $R^Y$ 是实施例G(即, $R^Y$ 是氢或氯), 并且 $R$ 是实施例G(即, $R$ 是甲基或氢),  $A^4$ 和 $A^5$ 是实施例E(即, $A^4$ 和 $A^5$ 都是CH),  $R^1$ 是实施例J(即, $R^1$ 是氢或甲基);  $R^{2a}$ 是实施例R(即, $R^{2a}$ 是氯、溴、碘、或三氟甲基),  $R^{2b}$ 是实施例I(即, $R^{2b}$ 是氯、溴、碘、或三氟甲基),  $R^3$ 是实施例C(即, $R^3$ 是甲基),  $Q$ 是实施例B(即, $Q$ 是 $Q^a$ , 其中 $R^4$ 是 $R^{4a}$ 或 $R^{4b}$ ), 其中 $Q^a$ 是 $Q^A-1$ ,  $R^{4a}$ 是实施例AA(即, $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是CH, 并且 $A^{34}$ 是CH),  $R^{4b}$ 是实施例B(即, $A^{14}$ 是N), 并且 $R^{4c}$ 是实施例F(即, $R^{4c}$ 是甲基或乙基)。

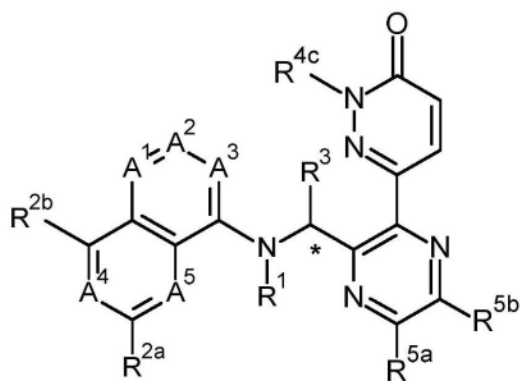
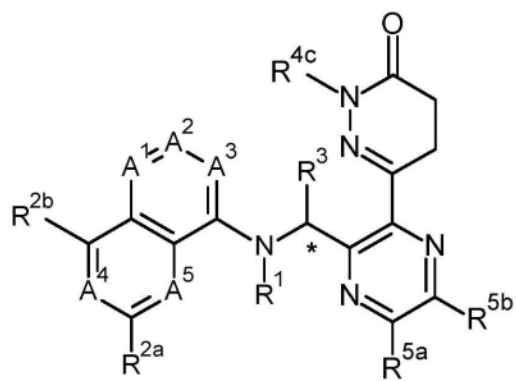
[0301] 在实施例中, 具有式(I)的化合物是式(I\*<sup>a</sup>)、(I\*<sup>b</sup>)、(I\*<sup>c</sup>)、(I\*<sup>d</sup>)、(I\*<sup>e</sup>)或(I\*<sup>f</sup>) (其中星号指示立体中心), 其中 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $A^5$ 、 $R$ 、 $R^1$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ 、 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5a}$ 、 $R^{5b}$ 和 $R^Y$ 是如第一方面中所定义的, 各自具有如上所述的对应实施例。

(I\*<sup>a</sup>)(I\*<sup>b</sup>)

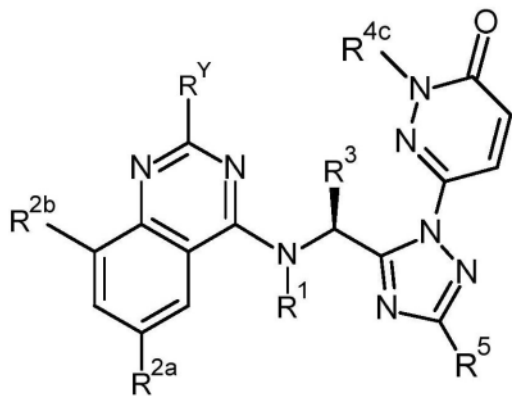
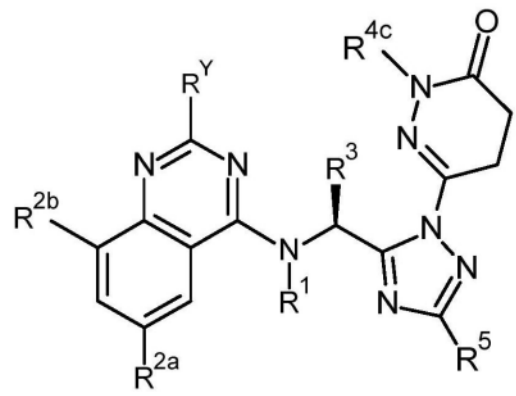
[0302]

(I\*<sup>c</sup>)(I\*<sup>d</sup>)

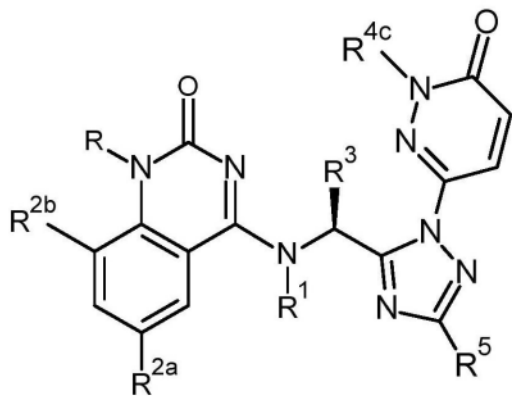
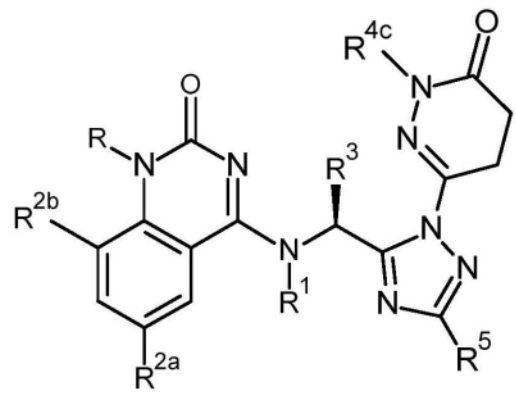
[0303]

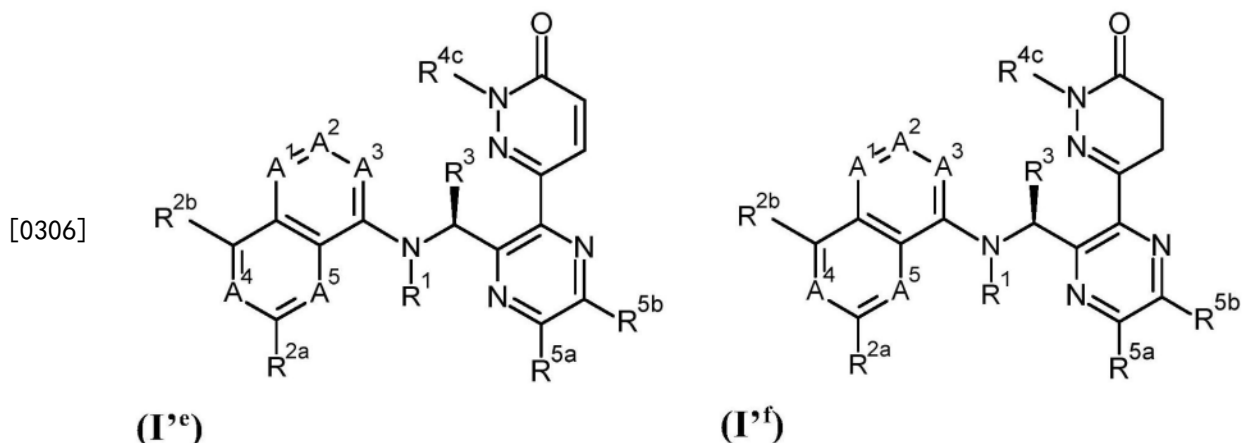
(I\*<sup>e</sup>)(I\*<sup>f</sup>)

[0304] 在实施例中,具有式(I')所描绘的优选立体化学的化合物对于具有式(I\*<sup>a</sup>)、(I\*<sup>b</sup>)、(I\*<sup>c</sup>)、(I\*<sup>d</sup>)、(I\*<sup>e</sup>)或(I\*<sup>f</sup>)的化合物也是优选的。在优选的实施例中,具有以下立体化学的具有式(I'<sup>a</sup>)、(I'<sup>b</sup>)、(I'<sup>c</sup>)、(I'<sup>d</sup>)、(I'<sup>e</sup>)或(I'<sup>f</sup>)的化合物是优选的:

(I'<sup>a</sup>)(I'<sup>b</sup>)

[0305]

(I'<sup>c</sup>)(I'<sup>d</sup>)

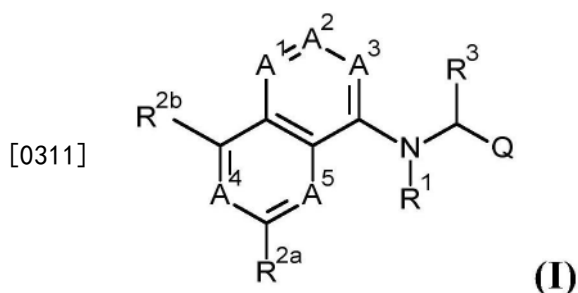


[0307] 其中 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $A^5$ 、 $R$ 、 $R^1$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ 、 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5a}$ 、 $R^{5b}$ 和 $R^Y$ 是如第一方面中所定义的,以及具有式(I'<sup>a</sup>)、(I'<sup>b</sup>)、(I'<sup>c</sup>)、(I'<sup>d</sup>)、(I'<sup>e</sup>)或(I'<sup>f</sup>)的化合物的立体异构体、对映异构体、互变异构体和N-氧化物,以及其农用化学上可接受的盐。

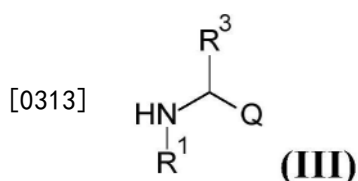
[0308] 具有式(I)的化合物可以由本领域技术人员按照已知的方法来制备。更具体地,具有式(I)的化合物、具有式(I')的化合物及其中间体可以如以下在方案和实例中所述制备。为了清楚起见,某些立体中心没有指明,并且不旨在以任何方式限制这些方案的传授内容。

[0309] 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。

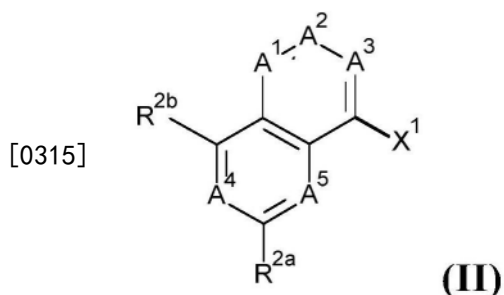
[0310] 具有式(I)的化合物



[0312] 其中 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $A^5$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $Q$ 、 $R^{2a}$ 和 $R^{2b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物给出的相同含义,可以通过以下方式制备:具有式(III)的胺

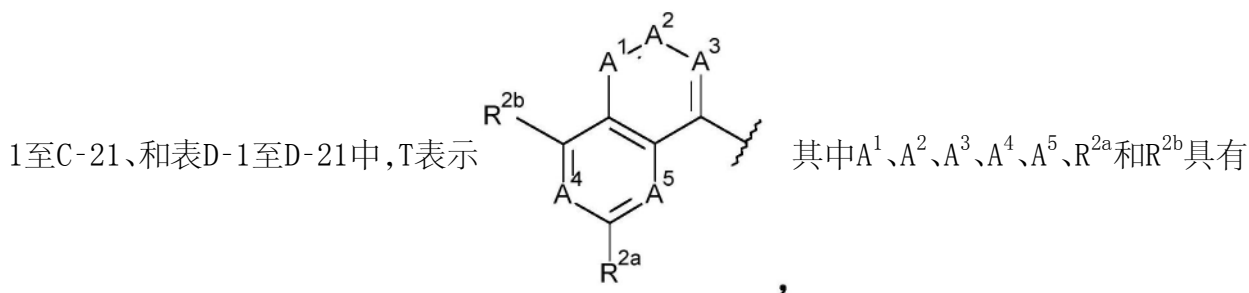


[0314] 或其盐(如氢卤化物盐,优选氢氯化物或氢溴化物盐、或三氟乙酸盐、或任何其他等效盐),其中 $R^1$ 、 $R^3$ 和 $Q$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物给出的相同含义,与具有式(II)的化合物的反应



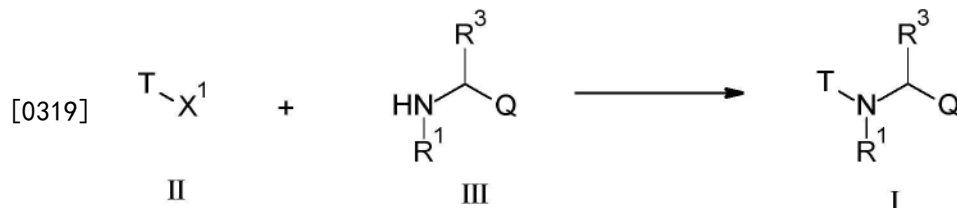
[0316] 其中 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $A^5$ 、 $R^{2a}$ 和 $R^{2b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物给出的相同含义,并且其中 $X^1$ 是离去基团,如卤素、羟基或磺酸酯。

[0317] 在整个说明书中,例如在以下方案1至11中,或在表A-1至A-78、表B-1至B-78、表C-



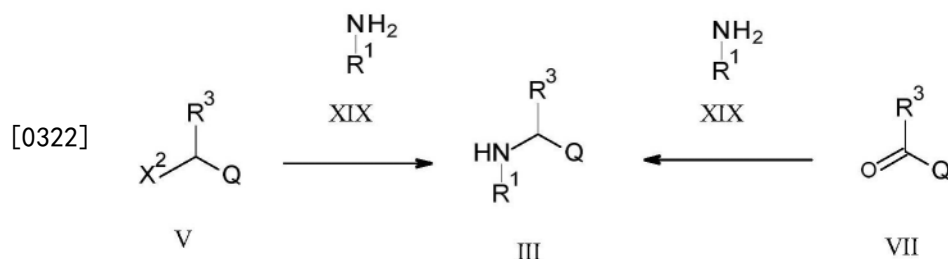
与以上对于具有式(I)的化合物给出的相同含义,并且其中交错线表示与化合物的其余部分的连接,如方案1至11中具有式(I)、(Ia)、(Ib)、(Ic)、(Id)、(Ie)、(If)、(Ig)、(Ih)、(II)、(IV)、(IVa)、(X)、(XI)、(XVII)的化合物。

[0318] 方案1:



[0320] 具有式(I)的化合物可以例如通过以下方式制得:具有式(II)的化合物(其中 $X^1$ 是离去基团,如卤素、羟基或磺酸酯,例如氯,并且其中T具有以上给出的含义)与具有式(III)的化合物或其盐(其中 $R^1$ 、 $R^3$ 和Q具有与以上对于具有式(I)的化合物给出的相同含义)的反应。在 $X^1$ 是羟基的情况下,可能有利的是在脱水试剂(例如肽偶联试剂,如像碳二亚胺或丙烷膦酸环酐(**T3P®**))的存在下进行该反应。这样的反应可以在 $-100^{\circ}\text{C}$ 至 $+300^{\circ}\text{C}$ 、优选在环境温度与 $200^{\circ}\text{C}$ 之间的温度范围内,在存在或不存在催化剂(例如金属催化剂,如钯络合物)的情况下,以及在添加或不添加碱(如无机碱(例如碳酸钠、碳酸钾或碳酸铯)或有机碱(例如像三乙胺、二异丙基乙胺或吡啶))的情况下,纯净进行或在溶剂中、优选在溶剂如有机溶剂例如乙腈、四氢呋喃、2-甲基四氢呋喃、乙酸乙酯、N,N-二甲基乙酰胺或N,N-二甲基甲酰胺中进行。具有式(II)的化合物是已知的或可以类似于例如在W0 2021/083936和W0 2021/177160中找到的说明制备,或它们可以通过本领域技术人员已知的方法制备。

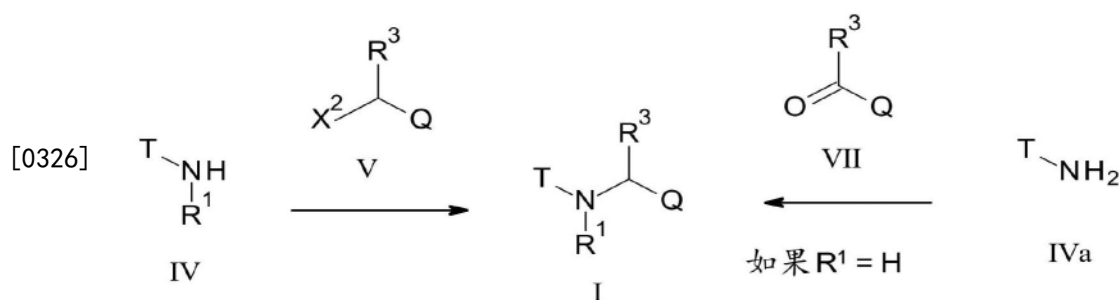
[0321] 方案2:



[0323] 具有式 (III) 的化合物或其盐可以例如如方案2中所示制得。将具有式 (V) 的化合物 (其中 $R^3$ 和 $Q$ 具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义并且其中 $X^2$ 是离去基团, 如卤素或磺酸酯, 例如溴) 用具有式 (XIX) 的胺或其盐 (其中 $R^1$ 具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义) 进行处理给出具有式 (III) 的化合物, 其中 $Q$ 、 $R^1$ 和 $R^3$ 具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义。该反应可以在 $-100^\circ\text{C}$ 至 $+300^\circ\text{C}$ 、优选地在环境温度与 $200^\circ\text{C}$ 之间的温度范围内, 在添加或不添加碱 (如无机碱 (例如碳酸钾) 或有机碱 (例如像三乙胺)) 的情况下, 纯净进行或在溶剂中, 优选在溶剂 (如有机溶剂, 例如乙腈) 中进行。

[0324] 可替代地, 将具有式 (VII) 的化合物 (其中 $R^3$ 和 $Q$ 具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义) 用具有式 (XIX) 的胺或其盐 (其中 $R^1$ 具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义) 进行处理给出具有式 (III) 的化合物, 其中 $Q$ 、 $R^1$ 和 $R^3$ 具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义。此反应在存在还原剂 (例如像氢、或氢化物如硼氢化钠) 的情况下, 在有或没有催化剂 (如氢化催化剂, 例如钨碳) 的情况下, 在存在或不存在酸 (如乙酸、或路易斯酸如溴化锌或异丙醇钛 (IV)) 的情况下, 在例如像甲醇的溶剂中或在没有溶剂的情况下进行。反应可以在 $-100^\circ\text{C}$ 至 $+300^\circ\text{C}$ 、优选地在环境温度与 $200^\circ\text{C}$ 之间的温度范围内进行。用于胺的烷基化和胺的还原烷基化的这样的方法以及进行它们的条件范围 (例如, 在 $\text{NaBH}(\text{OAc})_3$ 或 $\text{NaBH}_3\text{CN}$ 的存在下, 在合适的溶剂中, 优选在乙酸中, 在室温下, 类似于WO 2002/088073; 或可替代地, 通过使用 $\text{Ti}(\text{i-OiPr})_4$ 和 $\text{NaBH}_4$ 的组合, 如Synthesis[合成]2003 (14), 2206中所述) 是本领域技术人员熟知的。具有式 (XIX) 的胺或其盐 (其中 $R^1$ 具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义) 是已知的或它们可以通过本领域技术人员已知的方法制备。

[0325] 方案3:

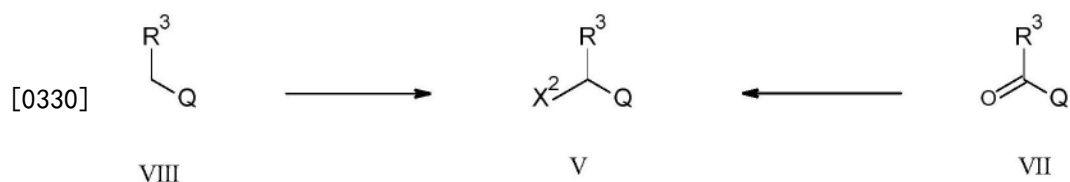


[0327] 可替代地, 具有式 (I) 的化合物可以例如通过以下方式制得: 具有式 (IV) 的化合物 (其中 $T$ 具有与以上在方案1中给出的相同含义, 并且 $R^1$ 具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义) 与具有式 (V) 的化合物 (其中 $R^3$ 和 $Q$ 具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义, 并且 $X^2$ 是离去基团, 如卤素或磺酸酯, 例如氯或溴) 的反应。该反应可以在 $-100^\circ\text{C}$ 至 $+300^\circ\text{C}$ 、优选地在环境温度与 $200^\circ\text{C}$ 之间的温度范围内, 在添加或不添加碱 (如无机碱 (例如碳酸钾) 或有机碱 (例如像三乙胺)) 的情况下, 纯净进行或在溶剂中, 优选在溶剂

(如有机溶剂,例如乙腈)中进行。用于胺的烷基化的这样的方法以及进行它们的条件范围是本领域技术人员众所周知的。

[0328] 可替代地,具有式 (I) 的化合物可以通过以下方式制得: 具有式 (IVa) 的化合物 (其中 T 具有与以上在方案 1 中给出的相同含义) 与具有式 (VII) 的化合物 (其中 R<sup>3</sup> 和 Q 具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义) 的反应。该反应在还原剂 (例如像氢或氢化物如硼氢化钠) 的存在下, 在有或没有催化剂 (如氢化催化剂例如钨碳) 的情况下, 在有或没有酸 (如乙酸或路易斯酸如溴化锌) 存在下, 在溶剂 (例如像甲醇) 中或在没有溶剂的情况下进行。反应可以在 -100℃ 至 +300℃、优选地在环境温度与 200℃ 之间的温度范围内进行。用于胺的还原性烷基化的这样的方法以及进行它们的条件范围是本领域技术人员众所周知的。

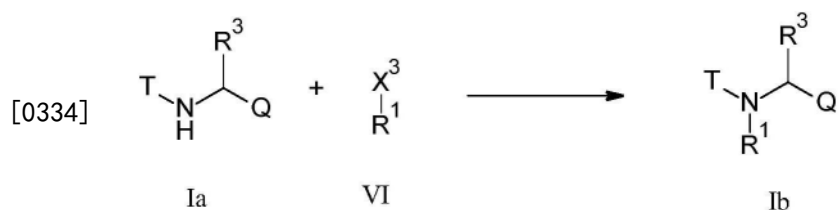
[0329] 方案 4:



[0331] 具有式 (V) 的化合物可以例如如方案 4 中所示制得。用卤化剂如氯或溴或者 N-溴琥珀酰亚胺处理具有式 (VIII) 的化合物例如给出具有式 (V) 的化合物, 其中离去基团 X<sup>2</sup> 是卤素, 例如氯或溴。该反应在有或没有溶剂的情况下、优选在溶剂中, 在有或没有添加剂 (如自由基起始剂, 例如像过氧化苯甲酰或偶氮异丁腈) 的情况下进行。该反应可以在暴露于或不暴露于可见光或紫外线的情况下进行, 并且该反应可以在 -100℃ 至 +300℃、优选地在环境温度与 200℃ 之间的温度范围内进行。

[0332] 可替代地, 可以用还原剂处理具有式 (VII) 的化合物, 然后与磺酰氯, 例如甲磺酰氯反应, 以给出具有式 (V) 的化合物, 其中离去基团 X<sup>2</sup> 是磺酸酯, 例如甲磺酸酯。该反应可以在溶剂中或在没有溶剂的情况下, 在碱 (如无机碱例如碳酸钾, 或有机碱如胺碱例如三甲基胺) 存在下或者在不存在碱的情况下进行, 并且其可以在 -100℃ 至 +300℃、优选在环境温度与 200℃ 之间的温度范围内进行。合适的还原剂可以是例如氢、或氢化物 (如硼氢化钠), 在有或没有催化剂 (如氢化催化剂例如钨碳) 的情况下, 在有或没有酸 (如乙酸或路易斯酸如溴化锌) 存在下, 在溶剂 (例如像甲醇) 中或在没有溶剂的情况下。反应可以在 -100℃ 至 +300℃、优选地在环境温度与 200℃ 之间的温度范围内进行。此类卤化、羰基化合物的还原和醇的磺酰化的方法以及实施它们的条件范围是本领域技术人员众所周知的。具有式 (VII) 的化合物和具有式 (VIII) 的化合物是已知的, 或者它们可以通过本领域技术人员已知的方法制备。

[0333] 方案 5:

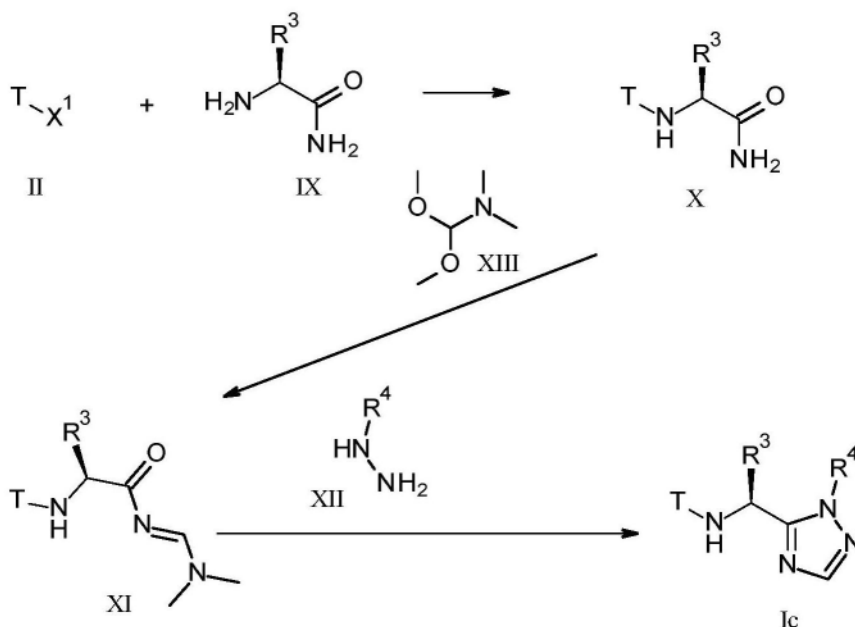


[0335] 可替代地, 具有式 (Ib) 的化合物 (其中 T 具有与以上在方案 1 中给出的相同含义, 并且 R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup> 和 Q 具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义, 除了 R<sup>1</sup> 不是氢) 可以例如

如方案5中所示制得。具有式 (Ia) 的化合物 (其中T具有与以上在方案1中给出的相同含义, 并且 $R^3$ 和Q具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义) 可以与具有式 (VI) 的化合物 (其中 $R^1$ 具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义, 除了 $R^1$ 不是氢, 并且其中 $X^3$ 是离去基团, 如卤素或磺酸酯, 例如氯、溴、碘或甲磺酸酯) 反应以给出具有式 (Ib) 的化合物。该反应可以在 $-100^{\circ}\text{C}$ 至 $+300^{\circ}\text{C}$ 、优选在环境温度与 $200^{\circ}\text{C}$ 之间的温度范围内, 在添加或不添加碱 (如无机碱 (例如碳酸钠、碳酸钾或碳酸铯) 或有机碱 (例如像三乙胺、二异丙基乙胺或吡啶)) 的情况下, 纯净进行或在溶剂中、优选在溶剂如有机溶剂例如乙腈、N,N-二甲基甲酰胺 (DMF) 或N,N-二甲基乙酰胺 (DMA) 或其混合物中进行。用于胺的烷基化的这样的方法以及进行它们的条件范围是本领域技术人员众所周知的。

[0336] 具有式 (VI) 的化合物 (其中 $R^1$ 具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义, 除了 $R^1$ 不是氢, 并且其中 $X^3$ 是离去基团, 如卤素或磺酸酯, 例如氯、溴、碘或甲磺酸酯) 是已知的, 或者它们可以通过本领域技术人员已知的方法制备。

[0337] 方案6:



[0339] 具有式 (Ic) 的化合物 (其中T具有与以上在方案1中给出的相同含义, 并且 $R^3$ 和 $R^4$ 具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义) 可以例如如方案6中所示制得。具有式 (II) 的化合物 (其中T具有与以上在方案1中给出的相同含义并且其中 $X^1$ 是离去基团, 如卤素或磺酸酯, 例如氯) 与具有式 (IX) 的化合物或其盐 (其中 $R^3$ 具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义) 的反应给出具有式 (X) 的化合物 (其中T具有与以上在方案1中给出的相同含义, 并且其中 $R^3$ 具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义)。该反应可以在 $-100^{\circ}\text{C}$ 至 $+300^{\circ}\text{C}$ 、优选在环境温度与 $200^{\circ}\text{C}$ 之间的温度范围内, 在存在或不存在催化剂 (例如金属催化剂, 如钯络合物) 的情况下, 以及在添加或不添加碱 (如无机碱 (例如碳酸钠、碳酸钾或碳酸铯) 或有机碱 (例如像三乙胺、二异丙基乙胺或吡啶)) 的情况下, 纯净进行或在溶剂中、优选在溶剂如有机溶剂例如乙腈、四氢呋喃、2-甲基四氢呋喃、乙酸乙酯、N,N-二甲基乙酰胺或N,N-二甲基甲酰胺中进行。

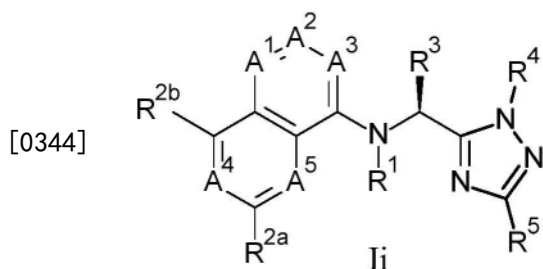
[0340] 具有式 (X) 的化合物 (其中T具有与以上在方案1中给出的相同含义, 并且其中 $R^3$ 具

有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义) 用已知的化合物 (XIII) (N,N-二甲基甲酰胺二甲基缩醛, DMF-DMA) 进行后续处理给出具有式 (XI) 的化合物 (其中T具有与以上在方案1中给出的相同含义, 并且其中R<sup>3</sup>具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义)。此反应可以在-100℃至+300℃、优选地在环境温度与100℃之间、或在环境温度与50℃之间的温度范围内, 在不存在碱或存在碱 (如无机碱 (例如碳酸钠、碳酸钾或碳酸铯) 或有机碱 (例如像三乙胺、二异丙基乙胺或吡啶)) 的情况下, 纯净进行或在溶剂中、优选在溶剂 (如有机溶剂, 例如二氯甲烷、四氢呋喃、2-甲基四氢呋喃或二噁烷) 中进行。

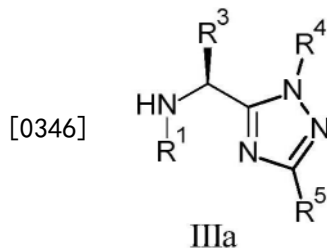
[0341] 具有式 (XI) 的化合物 (其中T具有与以上在方案1中给出的相同含义, 并且其中R<sup>3</sup>具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义) 与具有式 (XII) 的胍化合物或其互变异构体或其盐 (其中R<sup>4</sup>具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义、优选地R<sup>4</sup>是R<sup>4a</sup> (如上对于具有式 (I) 的化合物所定义的)) 的进一步的反应给出具有式 (Ic) 的化合物 (其中T具有与以上在方案1中给出的相同含义, 并且其中R<sup>3</sup>和R<sup>4</sup>具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义、优选地R<sup>4</sup>是R<sup>4a</sup> (如上对于具有式 (I) 的化合物所定义的))。该反应可以在-100℃至+300℃、优选在环境温度与200℃之间或在环境温度与80℃之间的温度范围内纯净进行或在溶剂中、优选在溶剂如有机溶剂例如1,4-二噁烷或乙酸或1,4-二噁烷和乙酸的混合物中进行。在该转化顺序内, 具有式 (X) 和式 (XI) 的中间体化合物可以作为粗产物用于后续步骤, 或者可以将它们纯化, 例如通过色谱法纯化, 并以纯化的形式用于下一转化。

[0342] 具有式 (IX) 的化合物或其盐 (其中R<sup>3</sup>具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义) 是已知的或它们可以通过本领域技术人员已知的方法制备。

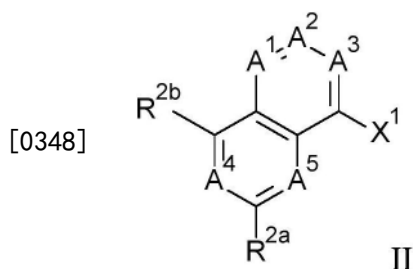
[0343] 具有式 (Ii) 的化合物



[0345] (其中A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、A<sup>4</sup>、A<sup>5</sup>、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>2a</sup>和R<sup>2b</sup>具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义) 可以通过以下方式制备: 具有式 (IIIa) 的胺或其盐 (如氢卤化物盐、优选地氢氯化物或氢溴化物盐, 或三氟乙酸盐或任何其他等效盐)

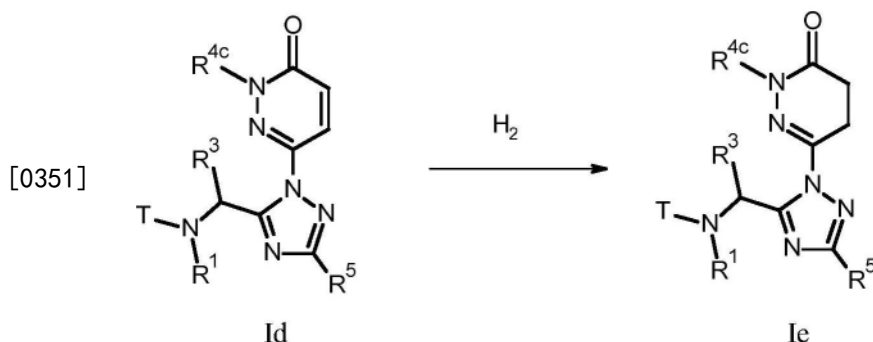


[0347] (其中R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>和R<sup>5</sup>是如在式 (I) 中所所述的) 与具有式 (II) 的化合物



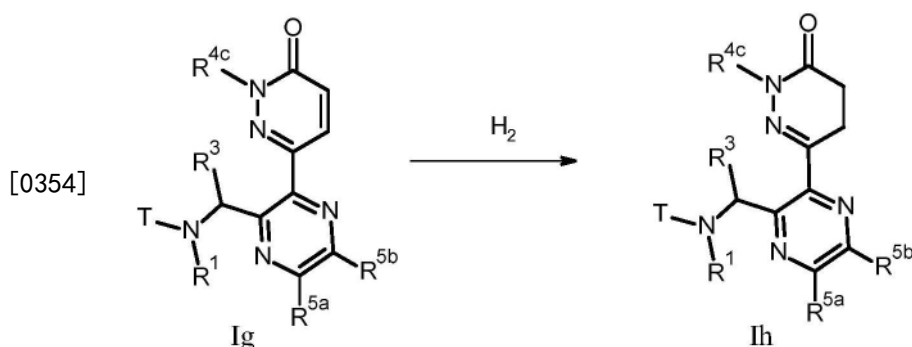
[0349] (其中 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $A^5$ 、 $R^{2a}$ 和 $R^{2b}$ 是如式(I)中所定义的并且 $X^1$ 是离去基团,如卤素或磺酸酯,例如氯)在已经描述于方案1中的条件下反应。

[0350] 方案7:



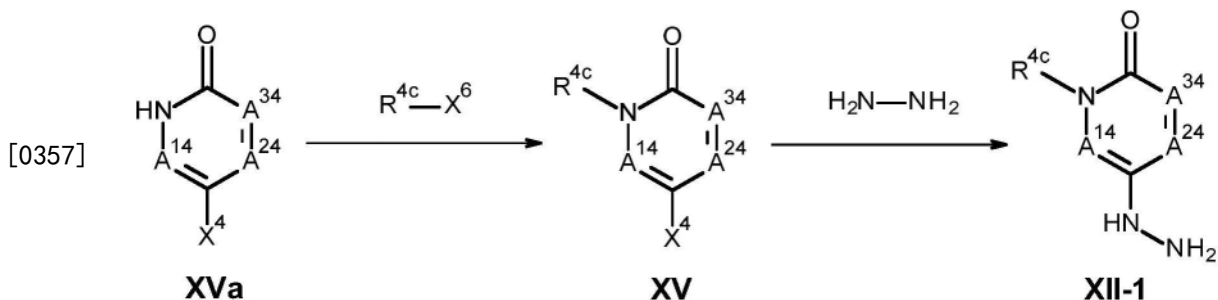
[0352] 具有式(Ie)的化合物(其中T具有与以上在方案1中给出的相同含义,并且 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 和 $R^5$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物给出的相同含义)可以(方案7)由具有式(Id)的化合物(其中T具有与以上在方案1中给出的相同含义,并且 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 和 $R^5$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物给出的相同含义)通过氢化反应制得。该反应可以在氢的存在下进行,或者通过转移氢化如像在甲酸或甲酸盐的存在下进行。该反应可以在催化剂(例如均相或非均相催化剂)的存在下进行。例如,反应是在钯催化剂(如钯碳)的存在下进行的。可能有利的是在溶剂中或纯净地、优选在溶剂中如像在作为溶剂的甲醇或乙醇中进行反应。反应可以在 $-100^{\circ}\text{C}$ 至 $+300^{\circ}\text{C}$ 、优选地在环境温度与 $200^{\circ}\text{C}$ 之间、或环境温度与 $80^{\circ}\text{C}$ 之间的温度范围内、任选地在压力容器中进行。

[0353] 方案7a:



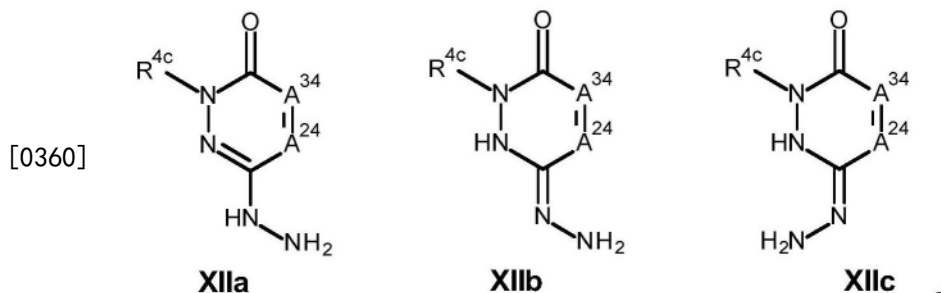
[0355] 类似地,具有式(Ih)的化合物(其中T具有与以上在方案1中给出的相同含义,并且 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物给出的相同含义)可以(方案7a)由具有式(Ig)的化合物(其中T具有与以上在方案1中给出的相同含义,并且 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物给出的相同含义)通过氢化反应在方案7中描述的类似条件下制得。

## [0356] 方案8:



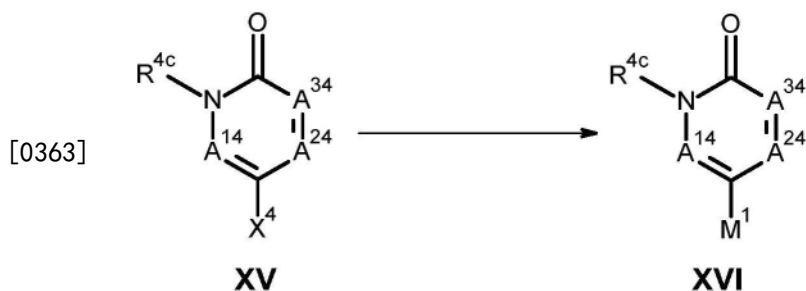
[0358] 具有式 (XII-1) 的化合物 (具有式 (XII) 的化合物的子集, 其中  $\text{R}^4$  具体是  $\text{R}^{4a}$  或其盐 (如氢卤化物盐、优选地氢氯化物或氢溴化物盐, 或三氟乙酸盐或任何其他等效盐), 其中  $\text{A}^{14}$ 、 $\text{A}^{24}$ 、 $\text{A}^{34}$  和  $\text{R}^{4c}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义, 可以 (方案8) 通过用肼或水合肼或其盐处理具有式 (XV) 的化合物 (其中  $\text{A}^{14}$ 、 $\text{A}^{24}$ 、 $\text{A}^{34}$  和  $\text{R}^{4c}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义, 并且  $\text{X}^4$  是离去基团, 如像卤素、磺酸酯、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -硫烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -亚磺酰基或  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -磺酰基) 制得。反应可以纯净地或在溶剂 (如像水, 醇如甲醇或乙醇, 或甲氧基环戊烷) 中在  $-100^\circ\text{C}$  与  $200^\circ\text{C}$  之间、更通常在  $0^\circ\text{C}$  与  $150^\circ\text{C}$  之间的温度下如像在  $100^\circ\text{C}$  下进行。这样的反应是从文献、例如从 *Bioorganic&Medicinal Chemistry Letters* [生物有机化学与医药化学通讯] (2012), 22 (2), 1226-1229 已知的。许多具有式 (XV) 的化合物是已知的或甚至是可商购的或者它们可以通过已知的方法制得。特别地, 具有式 (XV) 的化合物 (其中  $\text{A}^{14}$ 、 $\text{A}^{24}$ 、 $\text{A}^{34}$  和  $\text{R}^{4c}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义, 并且  $\text{X}^4$  是离去基团, 如像卤素、磺酸酯、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -硫烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -亚磺酰基或  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -磺酰基) 可以通过用具有式  $\text{R}^{4c}-\text{X}^6$  的试剂 (其中  $\text{R}^{4c}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义, 并且  $\text{X}^6$  是离去基团, 如卤素或磺酸酯, 例如氯、溴、碘或甲磺酸酯) 处理具有式 (XVa) 的化合物或其互变异构体 (其中  $\text{A}^{14}$ 、 $\text{A}^{24}$  和  $\text{A}^{34}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义, 并且  $\text{X}^4$  是离去基团, 如像卤素、磺酸酯、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -硫烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -亚磺酰基或  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -磺酰基) 制得。该反应可以在  $-100^\circ\text{C}$  至  $+300^\circ\text{C}$ 、优选在环境温度与  $200^\circ\text{C}$  之间的温度范围内, 在添加或不添加碱 (如无机碱 (例如碳酸钠、碳酸钾或碳酸铯) 或有机碱 (例如像三乙胺、二异丙基乙胺或吡啶)) 的情况下, 纯净进行或在溶剂中、优选在溶剂如有机溶剂例如乙腈、N,N-二甲基甲酰胺 (DMF) 或 N,N-二甲基乙酰胺 (DMA) 或其混合物中进行。这样的烷基化方法和进行它们的条件范围是本领域技术人员熟知的, 并且描述于例如 *Bioorganic&Medicinal Chemistry Letters* [生物有机化学与医药化学通讯] (2012), 22 (2), 1226-1229 中。具有式  $\text{R}^{4c}-\text{X}^6$  的试剂和具有式 (XVa) 的化合物或其互变异构体是已知的或甚至是可商购的或者它们可以通过已知的方法制得。

[0359] 具有式 (XIIa) 的化合物 (具有式 (XII-1) 化合物的子集, 其中  $\text{A}^{14}$  是 N) 或其盐 (其中  $\text{A}^{24}$ 、 $\text{A}^{34}$  和  $\text{R}^{4c}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义) 可以以不同的互变异构体形式, 如 (XIIb) 和/或 (XIIc), 或其盐存在, 其中  $\text{A}^{24}$ 、 $\text{A}^{34}$  和  $\text{R}^{4c}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义:



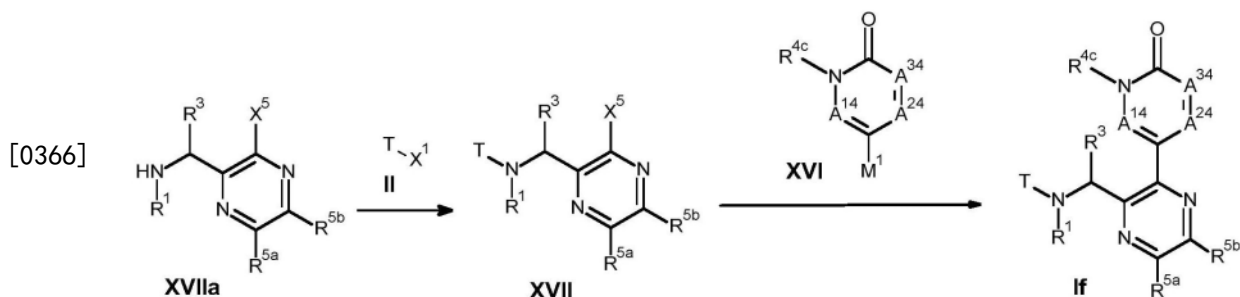
[0361] 本发明涵盖所有这样的互变异构体及其处于全部比例的混合物。

[0362] 方案9:



[0364] 具有式 (XVI) 的化合物 (其中  $A^{14}$ 、 $A^{24}$ 、 $A^{34}$  和  $R^{4c}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义相同含义, 并且  $M^1$  是含金属的取代基, 例如硼取代基或锡取代基, 如像三丁基甲锡烷基 ( $M^1$  是  $-\text{SnBu}_3$ )、二羟硼基 ( $M^1$  是  $-\text{B}(\text{OH})_2$ ) 或硼酸酯如 4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷-2-基) 可以 (方案9) 通过用三丁基 (三丁基甲锡烷基) 锡烷或二硼酸或 4,4,5,5-四甲基-2-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷-2-基)-1,3,2-二氧杂环戊硼烷 (也称为双(频哪醇合)二硼) 处理具有式 (XV) 的化合物 (其中  $A^{14}$ 、 $A^{24}$ 、 $A^{34}$  和  $R^{4c}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义相同含义, 并且  $X^4$  是离去基团, 如像卤素、磺酸酯、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -硫烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -亚磺酰基或  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -磺酰基) 制得。反应可以在催化剂 (如金属催化剂, 如钯催化剂, 例如乙酸钯) 的存在下并且在配体 (如膦配体, 例如 2-二环己基膦基-2',4',6'-三异丙基联苯 (XPhos)) 的存在下进行。反应可以在碱 (如醇盐或羧酸盐碱, 例如乙酸钾) 的存在下进行。反应可以纯净地或在溶剂 (如作为溶剂的二噁烷或甲苯) 中在  $-100^\circ\text{C}$  与  $200^\circ\text{C}$  之间、更通常在  $0^\circ\text{C}$  与  $150^\circ\text{C}$  之间的温度下如像在  $100^\circ\text{C}$  下进行。一些具有式 (XVI) 的化合物是已知的或甚至是可商购的或者它们可以通过已知的方法制得。

[0365] 方案10:



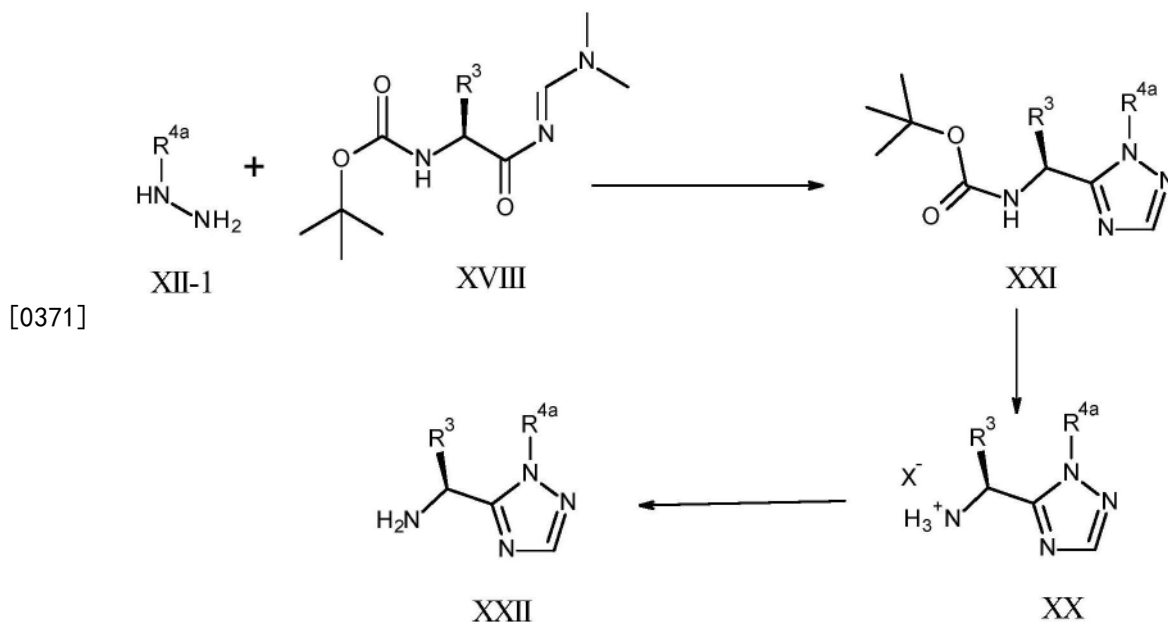
[0367] 具有式 (If) 的化合物 (其中 T 具有与以上在方案1中给出的相同含义, 并且其中  $A^{14}$ 、 $A^{24}$ 、 $A^{34}$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$  和  $R^{5b}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物给出的相同含义) 可以 (方案10) 由具有式 (XVII) 的化合物 (其中 T 具有与以上在方案1中给出的相同含义, 并且其中  $R^1$ 、

$R^3$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物给出的相同含义,并且其中 $X^5$ 是离去基团,如像氯、溴或碘)通过与具有式(XVI)的化合物(其中 $A^{14}$ 、 $A^{24}$ 、 $A^{34}$ 和 $R^{4c}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的相同含义,并且 $M^1$ 是含金属的取代基(其具有与以上在方案9中)给出的相同含义)反应制得。反应可以在催化剂(如钯催化剂,例如1,1'-双(二苯基膦基)-二茂铁]二氯化钯(II) ( $PdCl_2dppf$ ))的存在下,在碱(如碳酸盐碱,例如 $Cs_2CO_3$ ,或这样的羧酸盐碱,例如乙酸钾)的存在下进行。反应可以纯净地或在溶剂(如作为溶剂的二噁烷)中在-100℃与200℃之间、更通常在0℃与150℃之间的温度下如像在85℃下进行。这样的反应(被称为铃木-宫浦或施蒂勒交叉偶联反应)是本领域技术人员熟悉的。

[0368] 具有式(XVII)的化合物(其中T具有与以上在方案1中给出的相同含义,并且其中 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物给出的相同含义,并且其中 $X^5$ 是离去基团,如像氯、溴或碘)可以通过使具有式(XVIIa)的化合物或其盐(其中 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物给出的相同含义,并且其中 $X^5$ 是离去基团,如像氯、溴或碘)与具有式(II)的化合物(其中T具有与以上在方案1中给出的相同含义,并且其中 $X^1$ 是离去基团,如卤素或磺酸酯,例如氯)在已经在以上方案1中描述的类似条件下进行反应制得。

[0369] 具有式(XVIIa)的化合物或其盐(其中T具有与以上在方案1中给出的相同含义,并且其中 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物给出的相同含义,并且其中 $X^5$ 是离去基团,如像氯、溴或碘)从文献、例如从WO 2021/170881、WO 2021/037614、WO 2020/208036、WO 2020/201398或WO 2020/070049已知,或它们可以类似于其中找到的说明制得。

[0370] 方案11:



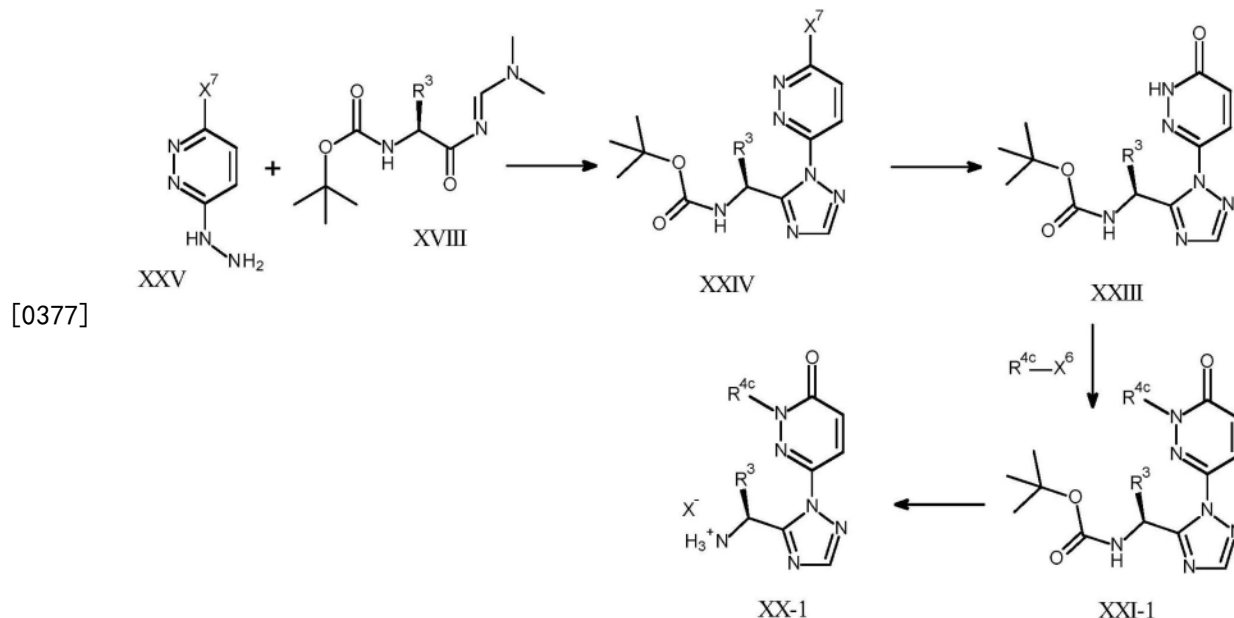
[0372] 具有式(XXII)的化合物(其中 $R^3$ 和 $R^{4a}$ 是如对于具有式(I)的化合物所定义的)可以(方案11)由具有式(XX)的化合物(其中 $R^3$ 和 $R^{4a}$ 是如对于具有式(I)的化合物所定义的并且 $X^-$ 是阴离子)通过用碱(如像氢氧化物碱或碳酸盐碱,例如氢氧化钠或碳酸钾)或离子交换树脂进行处理制得。这样程序是本领域技术人员熟知的并且从文献和教科书已知。

[0373] 阴离子 $X^-$ 是酸的共轭碱,该酸如无机酸,例如盐酸、氢溴酸、氟化氢、碘化氢、硫酸等,或有机酸,如羧酸或磺酸,例如三氟乙酸、甲磺酸或对甲苯磺酸。许多这样的酸是本领域技术人员已知的。

[0374] 具有式 (XX) 的化合物 (其中  $R^3$  和  $R^{4a}$  是如对于具有式 (I) 的化合物所定义的, 并且  $X^-$  是阴离子) 可以由具有式 (XXI) 的化合物 (其中  $R^3$  和  $R^{4a}$  是如对于具有式 (I) 的化合物所定义的) 通过用酸如以上列出的酸进行处理制得。反应可以纯净地或在溶剂中进行, 该溶剂如有机溶剂, 如甲醇、CPME、四氢呋喃、2-甲基四氢呋喃、二氯甲烷或二噁烷, 或无机溶剂, 如水, 或这样的溶剂的混合物。反应可以在  $-100^\circ\text{C}$  与  $200^\circ\text{C}$  之间、更通常在  $0^\circ\text{C}$  与  $150^\circ\text{C}$  之间的温度范围内如像在环境温度下进行。

[0375] 具有式 (XXI) 的化合物 (其中  $R^3$  和  $R^{4a}$  是如对于具有式 (I) 的化合物所定义的) 可以例如由具有式 (XII-1) 的化合物或其互变异构体或其盐 (其中  $R^{4a}$  是如对于具有式 (I) 的化合物所定义的) 通过用具有式 (XVIII) 的化合物 (其中  $R^3$  是如对于具有式 (I) 的化合物所定义的) 进行处理制得。反应可以纯净地或在溶剂 (如有机溶剂) 中或在溶剂的混合物 (作为溶剂的二噁烷和乙酸) 中进行。反应可以在干燥剂的存在或不存在下, 如像在分子筛存在下, 在  $-100^\circ\text{C}$  与  $200^\circ\text{C}$  之间、更通常在  $0^\circ\text{C}$  与  $150^\circ\text{C}$  之间的温度下如像在  $80^\circ\text{C}$  下进行。具有式 (XVIII) 的化合物 (其中  $R^3$  是如对于具有式 (I) 的化合物所定义的) 是例如从 WO 2021/083936 或 WO 2021/165195 已知的, 或它们可以类似于其中找到的说明制得。

[0376] 方案12:



[0378] 具有式 (XX-1) 的化合物 (具有式 (XX) 的化合物的子集, 其中  $R^3$  和  $R^{4c}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义并且  $X^-$  是阴离子, 该阴离子具有与以上在方案11中给出的同含义) 可以 (方案12) 由具有式 (XXI-1) 的化合物 (具有式 (XXI) 的化合物的子集, 其中  $R^3$  和  $R^{4c}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义) 通过用酸在已经在以上在方案11中描述的条件下进行处理制得 (XXI转变为XX)。

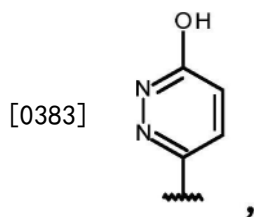
[0379] 具有式 (XXI-1) 的化合物 (具有式 (XXI) 的化合物的子集, 其中  $R^3$  和  $R^{4c}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义) 可以通过用具有式  $R^{4c}-X^6$  的试剂 (其中  $R^{4c}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义, 并且  $X^6$  是离去基团, 如卤素或磺酸酯, 例如氯、溴、碘或甲磺酸酯) 在已经在以上方案8中描述的条件下处理具有式 (XXIII) 的化合物或其互变异构体 (其中  $R^3$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义) 制得。

[0380] 具有式 (XXIII) 的化合物或其互变异构体 (其中  $R^3$  具有与以上对于具有式 (I) 的化

合物所定义的同含义)可以通过用例如苯甲醛肟 $\text{PhC}=\text{NOH}$ 、优选(E)-苯甲醛肟在碱(如碳酸钾或碳酸铯)的存在下,任选地在钌催化剂(如RockPhos-G3-环钌配合物([2-(2-叔丁基膦基-3-甲氧基-6-甲基-2',4',6'-三异丙基-1,1'-联苯基)-2-(2-氨基联苯基)]甲磺酸钌(II)))的存在下,在非质子溶剂(如乙腈或N,N-二甲基甲酰胺DMF)中,在0°C与100°C之间、优选室温与80°C之间的温度下处理基于式(XXIV)的化合物(其中 $\text{R}^3$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义并且其中 $\text{X}^7$ 是离去基团,如卤素,例如氯、溴或碘)制得,例如在Angew.Chem.Int.Ed.[应用化学国际版]56(16),4478-4482,2017中描述的。

[0381] 具有式(XXIV)的化合物(其中 $\text{R}^3$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义并且其中 $\text{X}^7$ 是离去基团,如卤素,例如氯、溴或碘)可以通过用具有式(XVIII)的化合物(其中 $\text{R}^3$ 是如对于具有式(I)的化合物所定义的)在已经在以上的方案11中描述的类似条件下处理具有式(XXV)的化合物或其互变异构体或其盐(其中 $\text{X}^7$ 是离去基团,如卤素,例如氯、溴或碘)制得(XII-1+XVIII转化为XXI)。具有式(XXV)的化合物或其互变异构体或其盐(其中 $\text{X}^7$ 是离去基团,如卤素,例如氯、溴或碘)是已知的或甚至可商购的,或它们可以通过已知的方法制得。

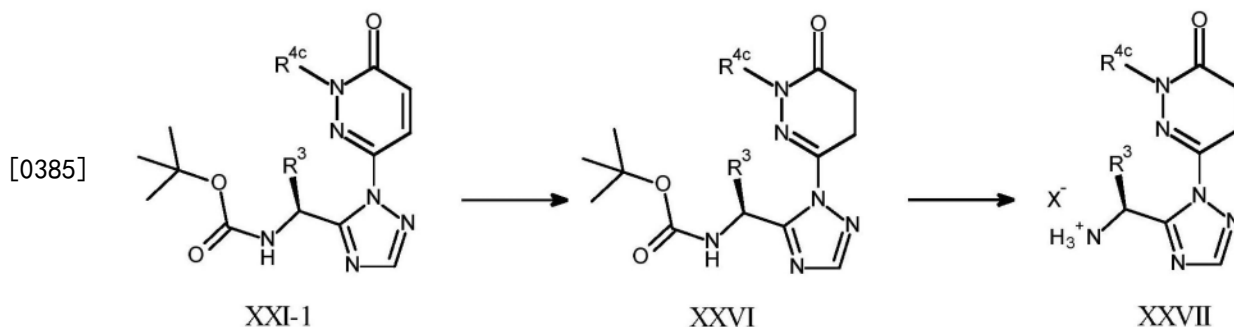
[0382] 具有式(XXIII)的化合物(所有取代基是如以上在方案12中所定义的)可以以不同的互变异构体形式存在



其中交错线表示与所述具有式(XXIII)化合物的剩余部分的连接。本发明

明涵盖所有这样的互变异构体及其处于全部比例的混合物。

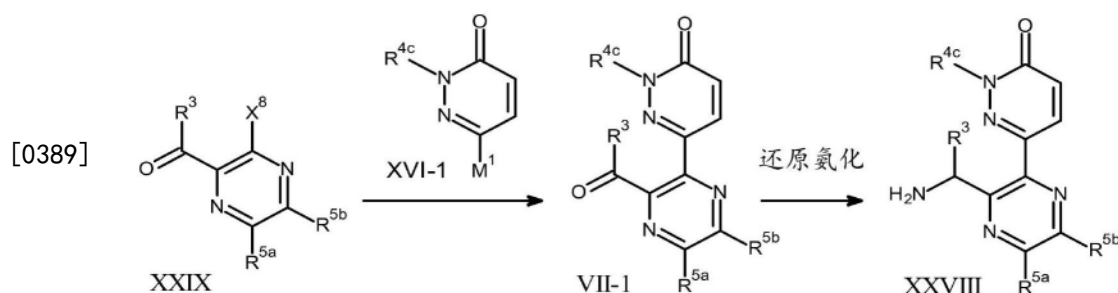
[0384] 方案13:



[0386] 具有式(XXVII)的化合物(其中 $\text{R}^3$ 和 $\text{R}^{4c}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义并且 $\text{X}^-$ 是阴离子,该阴离子具有与以上在方案11中给出的同含义)可以(方案13)由具有式(XXVI)的化合物(其中 $\text{R}^3$ 和 $\text{R}^{4c}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义)通过用酸在已经在以上在方案11中描述的条件下去处理制得(XXI转变为XX)。

[0387] 具有式(XXVI)的化合物(其中 $\text{R}^3$ 和 $\text{R}^{4c}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义)可以由以上所述的具有式(XXI-I)的化合物(其中 $\text{R}^3$ 和 $\text{R}^{4c}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义)通过氢化反应在已经在以上方案7中描述的类似条件下制得。

[0388] 方案14:

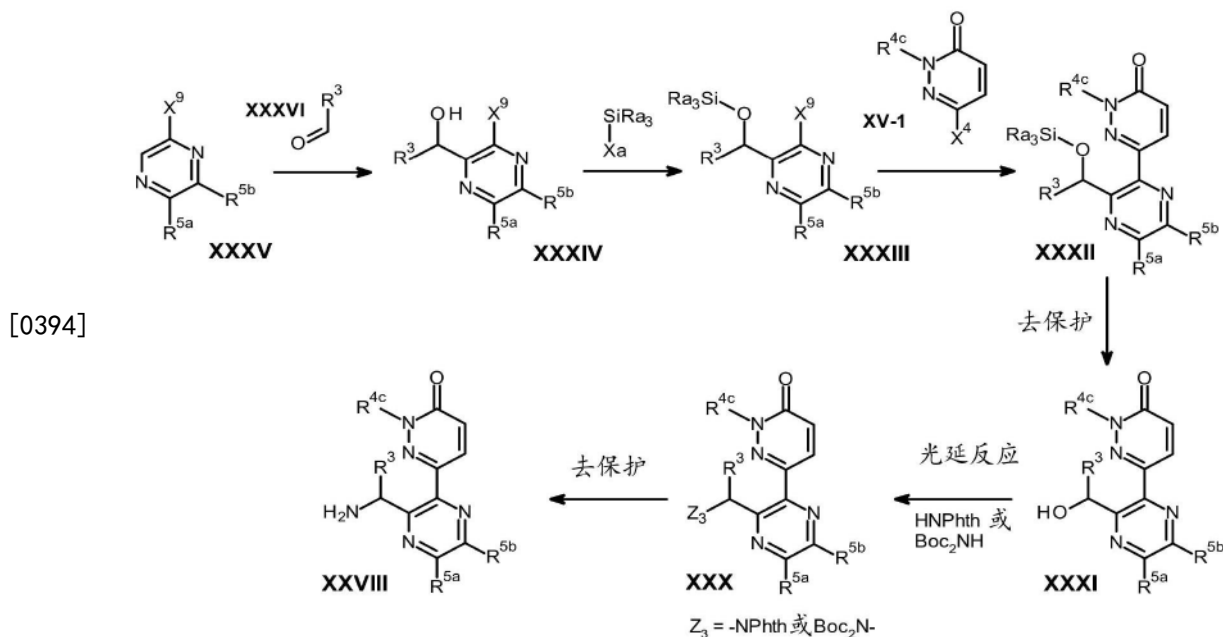


[0390] 具有式 (XXVIII) 的化合物或其盐 (如氢卤化物盐、优选地氢氯化物或氢溴化物盐, 或三氟乙酸盐或任何其他等效盐, 其中  $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$  和  $R^{5b}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义) 可以 (方案14) 由具有式 (VII-1) 的化合物 (具有式 (VII) 的化合物的子集, 其中  $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$  和  $R^{5b}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义) 通过还原胺化反应在已经在以上方案2中描述的类似条件下制得 (VII转化为III)。

[0391] 具有式 (VII-1) 的化合物 (具有式 (VII) 的化合物的子集, 其中  $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$  和  $R^{5b}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义) 可以通过用具有式 (XVI-1) 的化合物 (具有式 (XVI) 的化合物的子集, 其中  $R^{4c}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义并且  $M^1$  是具有与以上在方案9中给出的同含义的含金属的取代基) 在已经在以上方案10中描述的类似条件下处理具有式 (XXIX) 的化合物 (其中  $R^3$ 、 $R^{5a}$  和  $R^{5b}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义, 并且其中  $X^8$  是离去基团, 如卤素, 例如氯、溴或碘) 制得 (XVII+XVI转化为If)。具有式 (XXIX) 的化合物 (其中  $R^3$ 、 $R^{5a}$  和  $R^{5b}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义, 并且其中  $X^8$  是离去基团, 如卤素, 例如氯、溴或碘) 是已知的或甚至可商购的, 或它们可以通过已知的方法制得。

[0392] 可替代地, 具有式 (VII-1) 的化合物 (具有式 (VII) 的化合物的子集, 其中  $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$  和  $R^{5b}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义) 可以通过例如使用戴斯-马丁高碘烷 (Dess-Martin periodinane) (或类似的高价碘试剂) 氧化下述 (方案15) 具有式 (XXXI) 的化合物 (其中  $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$  和  $R^{5b}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义) 制得, 该氧化通常在氯化溶剂 (如二氯甲烷或氯仿) 中在  $0^\circ\text{C}$  与  $50^\circ\text{C}$  之间的温度下、优选在约室温下进行。

[0393] 方案15:



[0395] 可替代地,具有式(XXVIII)的化合物或其盐(如氢卤化物盐、优选地氢氯化物或氢溴化物盐,或三氟乙酸盐或任何其他等效盐),其中 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^{4c}$ 、 $\text{R}^{5a}$ 和 $\text{R}^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的含义,可以(方案15)由具有式(XXX)的化合物(其中 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^{4c}$ 、 $\text{R}^{5a}$ 和 $\text{R}^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的含义并且 $\text{Z}_3$ 是-NPhth(N-邻苯二甲酰亚胺基团)或-NBoc<sub>2</sub>(N-双(叔丁基氧基羰基)基团)典型地通过用肼(优选地水合肼或肼-水合物)在醇溶剂如乙醇或异丙醇( $\text{Z}_3$ 是-NPhth)或用酸如三氟乙酸或盐酸在合适溶剂(如二氯甲烷、四氢呋喃、2-甲基四氢呋喃或二噁烷( $\text{Z}_3$ 是-NBoc<sub>2</sub>))的存在下在本领域技术人员已知并且在文献中如像在以下中描述的去保护条件下进行处理制得:Protective Groups in Organic Synthesis[有机合成中的保护基],第三版,Theodora W.Green(The Rowland Institute for Science[罗兰科学研究所])和Peter G.M.Wuts(Pharmacia and Upjohn Company[法玛西亚和厄普约翰公司]),John Wiley&Sons,Inc.,[约翰威利父子公司]纽约州纽约1999,ISBN 0-471-16019-9。

[0396] 具有式(XXX)的化合物(其中 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^{4c}$ 、 $\text{R}^{5a}$ 和 $\text{R}^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的含义并且 $\text{Z}_3$ 是-NPhth(N-邻苯二甲酰亚胺基团)或-NBoc<sub>2</sub>(N-双(叔丁基氧基羰基)基团)可以由具有式(XXXI)的化合物(其中 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^{4c}$ 、 $\text{R}^{5a}$ 和 $\text{R}^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的含义)通过光延反应制得。这样的反应涉及在膦(如三苯基膦或三丁基膦)和胺(如邻苯二甲酰亚胺(HNPhth)或双(叔丁氧基羰基)胺(HNBoc<sub>2</sub>))存在下用偶氮二甲酸(如偶氮二甲酸二乙酯或偶氮二甲酸二异丙酯)处理具有式(XXXI)的化合物。光延反应(以及进行它们的条件)是本领域技术人员已知的并且描述于例如Chem.Rev.[化学评论]2009,109,2551-2651。

[0397] 具有式(XXXI)的化合物(其中 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^{4c}$ 、 $\text{R}^{5a}$ 和 $\text{R}^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的含义)可以由具有式(XXXII)的甲硅烷基醚化合物(其中 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^{4c}$ 、 $\text{R}^{5a}$ 和 $\text{R}^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的含义,并且其中基团Ra各自独立地是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基)通过去保护例如通过用氟化物例如用四丁基氟化铵在惰性溶剂如像四氢呋喃或2-甲基四氢呋喃中处理制得。反应可以在-10℃至80℃,例如在0℃与30℃之间的温度范围内进行。

这样的去保护反应是本领域技术人员已知的并且描述在文献中,例如描述于:Protective Groups in Organic Synthesis[有机合成中的保护基],第三版,Theodora W.Green(The Rowland Institute for Science[罗兰科学研究所])和Peter G.M.Wuts(Pharmacia and Upjohn Company[法玛西亚和厄普约翰公司]),John Wiley&Sons,Inc.,[约翰威利父子公司]纽约州纽约1999,ISBN 0-471-16019-9。

[0398] 可替代地,具有式(XXXI)的化合物(其中 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义)可以通过例如用硼氢化钠 $NaBH_4$ 在本领域技术人员已知的条件(参见例如WO 2012/082997,p.141)下、优选在作为溶剂的MeOH中还原以上所述(方案14)的具有式(VII-1)的化合物(具有式(VII)的化合物的子集,其中 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义)制得。

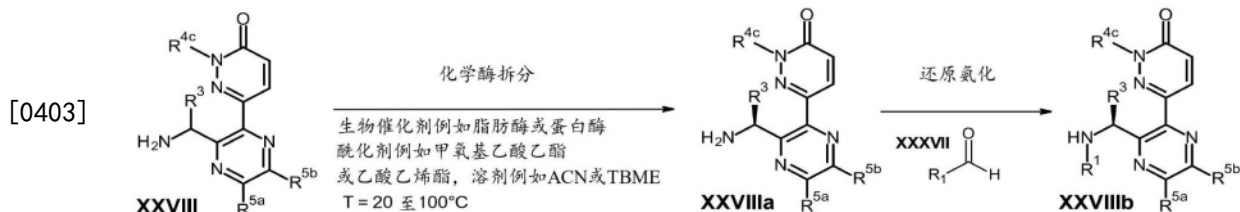
[0399] 具有式(XXXII)的化合物(其中 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义,并且其中基团Ra各自独立地是 $C_1$ - $C_4$ 烷基)可以由具有式(XXXIII)的甲硅烷基醚化合物(其中 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义, $X^9$ 是离去基团,如卤素,例如溴或碘,并且其中基团Ra各自独立地是 $C_1$ - $C_4$ 烷基)通过金属化,如通过用Turbo格氏试剂( $iPrMgCl \cdot LiCl$ )或丁基锂进行处理制得。这样的金属化是本领域技术人员已知的并且描述在文献中,例如描述于:Carey,Francis A. (2007). "Organometallic compounds of Group I and II metals[第I和II族金属的有机金属化合物]". Advanced Organic Chemistry: Reaction and Synthesis Pt.B[高等有机化学:反应和合成部分B](Kindle编辑). Springer[施普林格]. ISBN 978-0-387-44899-2。如此产生的锂或镁物质可以例如用卤化锌例如氯化锌转金属化,并且随后与具有式(XV-1)的化合物(具有式(XV)的化合物的子集,其中 $R^{4c}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义,并且 $X^4$ 是离去基团,如卤素,例如溴或碘)在催化剂(例如钯催化剂,例如三(二亚苺基丙酮)二钯(0))和配体(例如膦配体,如像三(2-呋喃基)膦)的存在下,在惰性溶剂(如像四氢呋喃或2-甲基四氢呋喃)中偶联。反应可以在-100℃至100℃,例如在-78℃与80℃之间的温度范围内进行。该转化是本领域技术人员已知的,例如作为根岸交叉偶联反应,并且描述于文献中,例如描述于以下:Jie Jack Li, Name Reactions, A Collection of Detailed Mechanisms and Synthetic Applications[人名反应:详细机制和合成应用的集合], Springer[施普林格], ISBN:978-3-030-50865-4。

[0400] 具有式(XXXIII)的化合物(其中 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义, $X^9$ 是离去基团,如卤素,例如溴或碘,并且其中基团Ra各自独立地是 $C_1$ - $C_4$ 烷基)可以由具有式(XXXIV)的化合物(其中 $R^3$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义,并且 $X^9$ 是离去基团,如卤素,例如溴或碘)通过用具有式 $Ra_3Si-Xa$ 的甲硅烷基化剂(其中 $Xa$ 是离去基团,如像氯、溴、碘或三氟甲烷磺酸酯,并且其中基团Ra各自独立地是 $C_1$ - $C_4$ 烷基( $Ra_3Si$ 是三烷基甲硅烷基,例如二甲基-叔丁基甲硅烷基;在化合物 $Ra_3Si-Xa$ 中,Ra是直链或支链 $C_1$ - $C_4$ 烷基,如甲基或叔丁基),在碱(如胺碱,例如咪唑)的存在下,在惰性溶剂(如像四氢呋喃或2-甲基四氢呋喃)中进行处理制得。反应可以在0℃至100℃,例如在10℃与80℃之间的温度范围内进行。这样的甲硅烷基化反应是本领域技术人员已知的并且描述在文献中,例如像描述于:Protective Groups in Organic Synthesis[有机合成中的保护基],第三版,Theodora W.Green(The Rowland Institute for Science[罗兰科学

研究所]) 和 Peter G.M. Wuts (Pharmacia and Upjohn Company [法玛西亚和厄普约翰公司]), John Wiley & Sons, Inc., [约翰威利父子公司] 纽约州纽约 1999, ISBN 0-471-16019-9。

[0401] 具有式 (XXXIV) 的化合物 (其中  $R^3$ 、 $R^{5a}$  和  $R^{5b}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义, 并且  $X^9$  是离去基团, 如卤素, 例如溴或碘) 可以由具有式 (XXXV) 的化合物 (其中  $R^{5a}$  和  $R^{5b}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义并且  $X^9$  是离去基团, 如卤素, 例如溴或碘) 通过用碱 (如氨基锂碱, 例如 2,2,6,6-四甲基哌啶锂) 进行处理然后使锂化物质与具有式 (XXXVI) 的醛化合物反应 (其中  $R^3$  具有与以上在式 (I) 中给出的同含义) 制得。该反应可以纯净地或在溶剂中, 例如在有机溶剂中, 如像在作为溶剂的四氢呋喃或 2-甲基四氢呋喃中。反应可以在  $-100^\circ\text{C}$  至  $100^\circ\text{C}$ , 例如在  $-80^\circ\text{C}$  与  $0^\circ\text{C}$  之间的温度范围内, 例如在  $0^\circ\text{C}$  或  $-78^\circ\text{C}$  下进行。具有式 (XXXV) 的化合物 (其中  $R^{5a}$  和  $R^{5b}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义, 并且  $X^9$  是离去基团, 如卤素, 例如溴或碘), 和具有式 (XXXVI) 的化合物 (其中  $R^3$  具有与以上在式 (I) 中给出的同含义) 是已知的或甚至可商购的, 或它们可以通过已知的方法制得。

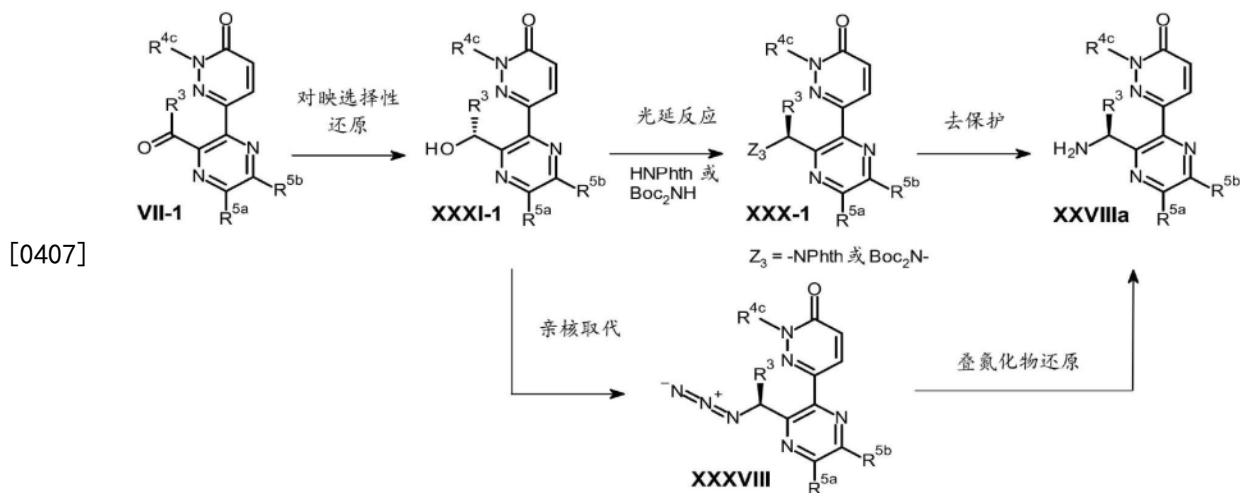
[0402] 方案 16:



[0404] 具有式 (XXVIIIb) 的化合物或其盐 (如氢卤化物盐、优选地氢氯化物或氢溴化物盐, 或三氟乙酸盐或任何其他等效盐), 其中  $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$  和  $R^{5b}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义, 可以 (方案 16) 通过用具有式 (XXXVII) 的化合物 (其中  $R^1$  是如式 I 中所定义的) 通过还原胺化反应在已经在以上方案 2 中描述的类似条件下处理具有式 (XXVIIIa) 的化合物或其盐 (其中  $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$  和  $R^{5b}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义) 制得 (VII 转化为 III)。

[0405] 具有式 (XXVIIIa) 的化合物或其盐 (其中  $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$  和  $R^{5b}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义) 可以通过生物催化去消旋化具有式 (XXVIII) 的化合物或其盐 (其中  $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$  和  $R^{5b}$  具有与以上对于具有式 (I) 的化合物所定义的同含义) 获得。这可以例如使用最终呈固定化形式 (例如 **Novozym®** 435) 的脂肪酶, 例如南极假丝酵母 (*Candida Antarctica*) 脂肪酶 B 或荧光假单胞菌 (*Pseudomonas fluorescens*) 脂肪酶, 在酰基供体 (例如甲氧基乙酸乙酯或乙酸乙烯酯) 的存在下, 在合适的溶剂 (如乙腈或甲基叔丁基醚) 中, 在  $20^\circ\text{C}$  至  $100^\circ\text{C}$  之间的温度下进行。此类方法例如描述于 J. Org. Chem. [有机化学杂志] 2007, 72, 6918-6923 或 Adv. Synth. Catal. [高级合成与催化] 2007, 349, 1481-1488 中。这种酶去消旋化的预期立体化学结果是本领域技术人员已知的并且记录于文献中, 例如 J. Org. Chem. [有机化学杂志] 1991, 56, 2656-2665 或 J. Am. Chem. Soc. [美国化学学会杂志] 2015, 137, 3996-4009 中。

[0406] 方案 17:



[0408] 在替代过程(方案17)中,具有式(XXVIIIa)的化合物或其盐(其中 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义)可以由具有式(XXX-1)的化合物(其中 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义并且 $Z_3$ 是-NPhth(N-邻苯二甲酰亚胺基团)或-NBoc<sub>2</sub>(N-双(叔丁基氧基羰基)基团)在已经在以上方案15中描述的去保护条件下获得(XXX转化为XXVIII)。

[0409] 具有式(XXX-1)的化合物(其中 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义并且 $Z_3$ 是-NPhth(N-邻苯二甲酰亚胺基团)或-NBoc<sub>2</sub>(N-双(叔丁基氧基羰基)基团)可以由具有式(XXXI-1)的化合物(其中 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义)通过与邻苯二甲酰亚胺(HNPhth)或双(叔丁氧基羰基)胺(HNBoc<sub>2</sub>)的光延反应在已经在以上的方案15中描述的条件下获得(XXXI转化为XXX)。这样的过程由本领域技术人员已知用于进行立构中心的翻转。

[0410] 具有式(XXXI-1)的化合物(其中 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义)可以通过对映选择性还原具有式(VII-1)的酮(其中 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义)获得。此类还原可以在氢供体体系(例如像HCOOH/Et<sub>3</sub>N或HCO<sub>2</sub>NH<sub>4</sub>)的存在下使用催化剂(例如具有手性配体的钌或铑催化剂如RuCl[(R,R)-TsDPEN](均三甲苯)或RuBF<sub>4</sub>[(R,R)-TsDPEN](对伞花烃))进行。此类方法描述于文献中,例如描述于J.Org.Chem.[有机化学杂志]2017,82,5607中。

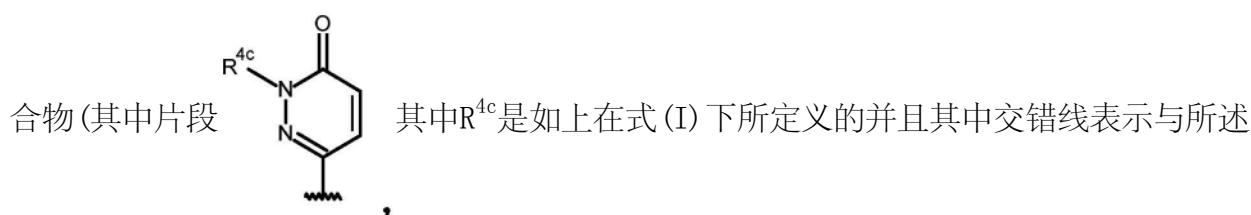
[0411] 可替代地,具有式(XXVIIIa)的化合物或其盐(其中 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义)可以通过经由用例如三苯基膦(或三丁基膦)和水(两步施陶丁格还原)处理或通过使用例如钯催化剂在氢的存在下氢化还原具有式(XXXVIII)的叠氮化物化合物(其中 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义)获得。这样的叠氮化物还原的程序和条件是本领域技术人员熟知的并且从文献和教科书已知。

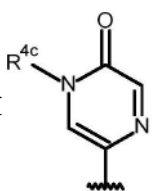
[0412] 具有式(XXXVIII)的化合物(其中 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于具有式(I)的化合物所定义的同含义)可以通过用叠氮化试剂(如二苯基磷酰基叠氮化物,除其他之外如叠氮化钠、三甲基甲硅烷基叠氮化物或四丁基叠氮化铵)在溶剂(如甲苯、四氢呋喃或2-甲基四氢呋喃)中,在碱(如像1,8-二氮杂二环(5.4.0)十一碳-7-烯DBU)的存在下并且在优选地约室温的温度下处理具有式(XXXI-1)的醇化合物(其中 $R^3$ 、 $R^{4c}$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{5b}$ 具有与以上对于

具有式(I)的化合物所定义的不同含义)获得。此类方法由本领域技术人员已知用于进行立构中心的翻转并且描述于文献中,例如描述于Adv.Synth.Catal.[高级合成与催化]2018, 360, 2157-2165中。

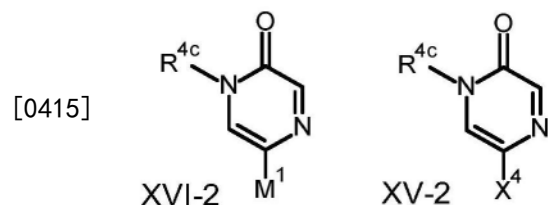
[0413] 具有式(XX)、(XXII)(取代基如方案11中所定义的)、式(XX-1)(取代基如方案12中所定义的)、式(XXVII)(取代基如方案13中所定义的)、式(XXVIII)(取代基如方案14/15中所定义的)、式(XXVIIIa)(取代基如方案16/17中所定义的)和式(XXVIIIb)(取代基如方案16中所定义的)的化合物中任一种或(在适用的情况下)其盐或(在适用的情况下)其游离碱表示以上在方案1中所定义的具有式(III)的化合物的特定子集,因此可以根据所述方案1中概述的说明用于制备具有式(I)的化合物。

[0414] 具有式(XXVIII)、(XXVIIIa)或(XXVIIIb)(取代基定义如方案14、15、16和17)的化



具有式(XXVIII)、(XXVIIIa)或(XXVIIIb)的化合物的剩余部分的连接,被片段 

代)可以类似于方案14、15、16和17中找到的化学描述获得,但是通过分别用具有式XVI-2和XV-2的化合物替代具有式XVI-1和XV-1的起始材料,其中R<sup>4c</sup>、X<sup>4</sup>和M<sup>1</sup>保留其定义:



[0416] 这样的具有式XVI-2和XV-2的化合物是已知的或甚至是可商购的或者它们可以通过已知的方法制得。

[0417] 取决于程序或反应条件,反应物可在碱存在下反应。合适的碱的实例是碱金属或碱土金属氢氧化物、碱金属或碱土金属氢化物、碱金属或碱土金属酰胺、碱金属或碱土金属醇盐、碱金属或碱土金属乙酸盐、碱金属或碱土金属碳酸盐、碱金属或碱土金属二烷基酰胺或碱金属或碱土金属烷基甲硅烷基酰胺、烷基胺、亚烷基二胺、游离的或N-烷基化的饱和或不饱和的环烷基胺、碱性杂环、氢氧化铵以及碳环胺。可以提及的实例是氢氧化钠、氢化钠、氨基钠、甲醇钠、乙酸钠、碳酸钠、叔丁醇钾、氢氧化钾、碳酸钾、氢化钾、二异丙氨基锂、双(三甲基甲硅烷基)氨基钾、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、苄基三甲基铵氢氧化物以及1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯(DBU)。

[0418] 这些反应物可以按照原样彼此进行反应,即:不添加溶剂或稀释剂。然而,在大多数情况下,添加惰性溶剂或稀释剂或这些的混合物是有利的。如果该反应在碱的存在下进

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。

[0419] 这些反应有利地在从约-80℃到约+140℃、优选从约-30℃到约+100℃的温度范围内,在许多情况下在环境温度与约+80℃之间的范围内进行。

[0420] 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。

[0421] 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合适的离子交换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合适的离子交换试剂进行处理来获得的。

[0422] 具有式(I)的化合物的盐能够以常规方式转化为具有式(I)的游离化合物、酸加成盐(例如通过用合适的碱性化合物或用合适的离子交换剂试剂进行处理)以及与碱的盐(例如通过用合适的酸或用合适的离子交换剂试剂进行处理)。

[0423] 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,例如转变成成为其他酸加成盐,例如通过在合适的溶剂中用酸的合适的金属盐(如钠盐、钡盐或银盐,例如用乙酸银)来处理无机酸的盐(如盐酸盐),在该溶剂中,所形成的无机盐(例如氯化银)是不溶的并且因此从该反应混合物中沉淀出。

[0424] 取决于程序或反应条件,具有成盐特性的具有式(I)的化合物能以游离形式或盐的形式获得。

[0425] 根据分子中存在的不对称碳原子的数目、绝对和相对构型和/或根据分子中存在的非芳香族双键的构型,在每种情况下呈游离形式或呈盐形式的具有式(I)的化合物和适当时其互变异构体可以可能的异构体之一的形式或作为其混合物存在,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。

[0426] 呈游离形式或盐形式的具有式(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)可以在这些组分的物理化学差异的基础上,例如通过分级结晶、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。

[0427] 能够以类似方式获得的对映异构体混合物(如外消旋体)可以通过已知方法拆分成光学对映体,例如通过从光学活性溶剂再结晶;通过在手性吸附剂上的色谱法,例如在乙酰纤维素上的高效液相色谱法(HPLC);借助于适合的微生物,通过用特异性固定化酶裂解;通过形成包含化合物,例如使用手性冠醚,其中仅一个对映异构体被络合;或通过转化成非对映异构体的盐,例如通过使碱性最终产物外消旋体与光学活性酸(如羧酸,例如樟脑酸、酒石酸或苹果酸,或磺酸,例如樟脑磺酸)反应,并且分离能够以此方式获得的非对映异构体混合物,例如基于其不同溶解度通过分步结晶,从而获得非对映异构体,从该非对映异构体可以通过适合的试剂(例如碱性试剂)的作用使所希望的对映异构体变成游离的。

[0428] 纯的非对映异构体或对映异构体能根据本发明来获得,不仅是通过分离适合的异

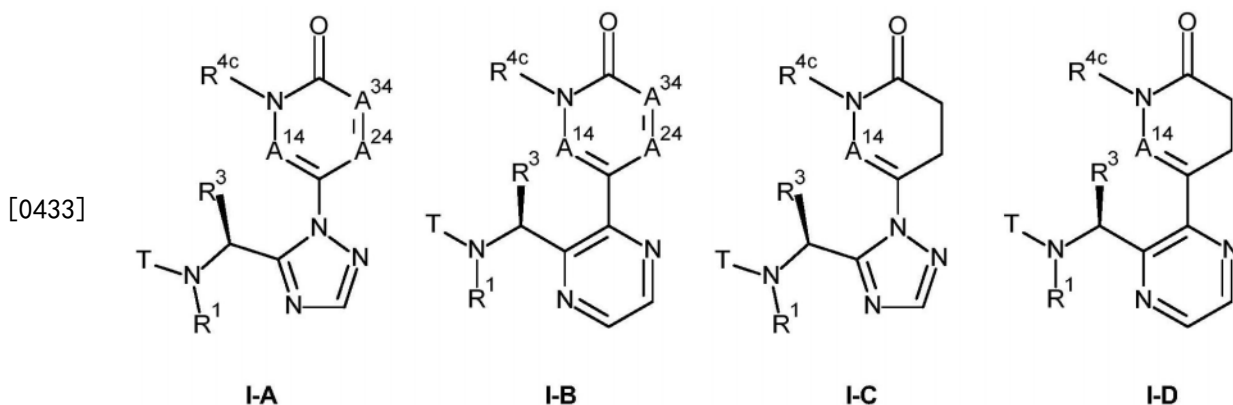
构体混合物,还可以是通过普遍已知的非对映立体选择性或对映选择性合成的方法,例如通过根据本发明用具有适合的立体化学的起始材料进行该方法。

[0429] 可以通过使具有式(I)的化合物与合适的氧化剂(例如 $H_2O_2$ /尿素加合物)在酸酐(例如,三氟乙酸酐)存在下反应制备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。

[0430] 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。

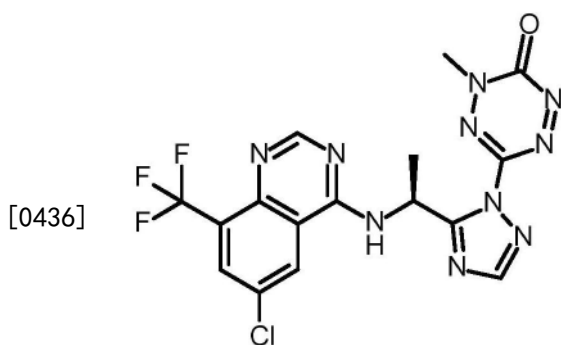
[0431] 具有式(I)的化合物和适当时其互变异构体(在每种情况下呈游离形式或呈盐形式)如果适当的话还能以水合物的形式获得和/或包括其他溶剂,例如可以用于使以固体形式存在的化合物结晶的那些。

[0432] 根据下表A-1至A-78、B-1至B-78、C-1至C-21和D-1至D-21的具有式(I)的化合物可以根据以上所述方法制备。随后的实例旨在说明本发明并且示出优选的具有式(I)的化合物(以具有式(I-A)、(I-B)、(I-C)和(I-D)的化合物的形式)。



[0434] 表A-1至A-78(式I-A)

[0435] 表A-1提供了32种具有式I-A的化合物A-1.001至A-1.032,其中 $A^{14}$ 是N, $A^{24}$ 是N, $A^{34}$ 是N, $R^1$ 是H, $R^3$ 是 $CH_3$ , $R^{4c}$ 是 $CH_3$ 并且T是如表Z中所定义的。例如,A-1.002是



**A-1.002。**

[0437] 表A-2提供了32种具有式I-A的化合物A-2.001至A-2.032,其中 $A^{14}$ 是N, $A^{24}$ 是N, $A^{34}$ 是N, $R^1$ 是H, $R^3$ 是 $CH_3$ , $R^{4c}$ 是 $CH_2-CF_2H$ 并且T是如表Z中所定义的。

[0438] 表A-3提供了32种具有式I-A的化合物A-3.001至A-3.032,其中 $A^{14}$ 是N, $A^{24}$ 是N, $A^{34}$ 是N, $R^1$ 是H, $R^3$ 是 $CH_3$ , $R^{4c}$ 是 $CH_2$ -环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0439] 表A-4提供了32种具有式I-A的化合物A-4.001至A-4.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0440] 表A-5提供了32种具有式I-A的化合物A-5.001至A-5.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0441] 表A-6提供了32种具有式I-A的化合物A-6.001至A-6.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0442] 表A-7提供了32种具有式I-A的化合物A-7.001至A-7.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0443] 表A-8提供了32种具有式I-A的化合物A-8.001至A-8.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0444] 表A-9提供了32种具有式I-A的化合物A-9.001至A-9.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0445] 表A-10提供了32种具有式I-A的化合物A-10.001至A-10.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0446] 表A-11提供了32种具有式I-A的化合物A-11.001至A-11.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0447] 表A-12提供了32种具有式I-A的化合物A-12.001至A-12.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0448] 表A-13提供了32种具有式I-A的化合物A-13.001至A-13.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0449] 表A-14提供了32种具有式I-A的化合物A-14.001至A-14.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0450] 表A-15提供了32种具有式I-A的化合物A-15.001至A-15.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0451] 表A-16提供了32种具有式I-A的化合物A-16.001至A-16.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0452] 表A-17提供了32种具有式I-A的化合物A-17.001至A-17.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0453] 表A-18提供了32种具有式I-A的化合物A-18.001至A-18.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0454] 表A-19提供了32种具有式I-A的化合物A-19.001至A-19.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0455] 表A-20提供了32种具有式I-A的化合物A-20.001至A-20.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0456] 表A-21提供了32种具有式I-A的化合物A-21.001至A-21.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0457] 表A-22提供了32种具有式I-A的化合物A-22.001至A-22.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0458] 表A-23提供了32种具有式I-A的化合物A-23.001至A-23.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是

CH, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0459] 表A-24提供了32种具有式I-A的化合物A-24.001至A-24.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0460] 表A-25提供了32种具有式I-A的化合物A-25.001至A-25.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0461] 表A-26提供了32种具有式I-A的化合物A-26.001至A-26.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0462] 表A-27提供了32种具有式I-A的化合物A-27.001至A-27.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0463] 表A-28提供了32种具有式I-A的化合物A-28.001至A-28.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0464] 表A-29提供了32种具有式I-A的化合物A-29.001至A-29.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0465] 表A-30提供了32种具有式I-A的化合物A-30.001至A-30.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0466] 表A-31提供了32种具有式I-A的化合物A-31.001至A-31.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0467] 表A-32提供了32种具有式I-A的化合物A-32.001至A-32.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0468] 表A-33提供了32种具有式I-A的化合物A-33.001至A-33.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0469] 表A-34提供了32种具有式I-A的化合物A-34.001至A-34.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0470] 表A-35提供了32种具有式I-A的化合物A-35.001至A-35.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0471] 表A-36提供了32种具有式I-A的化合物A-36.001至A-36.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0472] 表A-37提供了32种具有式I-A的化合物A-37.001至A-37.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0473] 表A-38提供了32种具有式I-A的化合物A-38.001至A-38.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0474] 表A-39提供了32种具有式I-A的化合物A-39.001至A-39.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0475] 表A-40提供了32种具有式I-A的化合物A-40.001至A-40.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0476] 表A-41提供了32种具有式I-A的化合物A-41.001至A-41.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0477] 表A-42提供了32种具有式I-A的化合物A-42.001至A-42.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0478] 表A-43提供了32种具有式I-A的化合物A-43.001至A-43.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0479] 表A-44提供了32种具有式I-A的化合物A-44.001至A-44.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0480] 表A-45提供了32种具有式I-A的化合物A-45.001至A-45.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0481] 表A-46提供了32种具有式I-A的化合物A-46.001至A-46.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0482] 表A-47提供了32种具有式I-A的化合物A-47.001至A-47.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0483] 表A-48提供了32种具有式I-A的化合物A-48.001至A-48.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0484] 表A-49提供了32种具有式I-A的化合物A-49.001至A-49.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0485] 表A-50提供了32种具有式I-A的化合物A-50.001至A-50.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0486] 表A-51提供了32种具有式I-A的化合物A-51.001至A-51.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0487] 表A-52提供了32种具有式I-A的化合物A-52.001至A-52.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0488] 表A-53提供了32种具有式I-A的化合物A-53.001至A-53.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0489] 表A-54提供了32种具有式I-A的化合物A-54.001至A-54.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0490] 表A-55提供了32种具有式I-A的化合物A-55.001至A-55.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0491] 表A-56提供了32种具有式I-A的化合物A-56.001至A-56.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0492] 表A-57提供了32种具有式I-A的化合物A-57.001至A-57.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0493] 表A-58提供了32种具有式I-A的化合物A-58.001至A-58.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0494] 表A-59提供了32种具有式I-A的化合物A-59.001至A-59.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0495] 表A-60提供了32种具有式I-A的化合物A-60.001至A-60.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0496] 表A-61提供了32种具有式I-A的化合物A-61.001至A-61.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0497] 表A-62提供了32种具有式I-A的化合物A-62.001至A-62.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是

CH, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0498] 表A-63提供了32种具有式I-A的化合物A-63.001至A-63.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0499] 表A-64提供了32种具有式I-A的化合物A-64.001至A-64.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0500] 表A-65提供了32种具有式I-A的化合物A-65.001至A-65.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0501] 表A-66提供了32种具有式I-A的化合物A-66.001至A-66.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0502] 表A-67提供了32种具有式I-A的化合物A-67.001至A-67.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0503] 表A-68提供了32种具有式I-A的化合物A-68.001至A-68.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0504] 表A-69提供了32种具有式I-A的化合物A-69.001至A-69.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0505] 表A-70提供了32种具有式I-A的化合物A-70.001至A-70.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0506] 表A-71提供了32种具有式I-A的化合物A-71.001至A-71.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0507] 表A-72提供了32种具有式I-A的化合物A-72.001至A-72.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0508] 表A-73提供了32种具有式I-A的化合物A-73.001至A-73.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0509] 表A-74提供了32种具有式I-A的化合物A-74.001至A-74.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0510] 表A-75提供了32种具有式I-A的化合物A-75.001至A-75.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0511] 表A-76提供了32种具有式I-A的化合物A-76.001至A-76.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0512] 表A-77提供了32种具有式I-A的化合物A-77.001至A-77.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0513] 表A-78提供了32种具有式I-A的化合物A-78.001至A-78.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0514] 表B-1至B-78(式I-B)

[0515] 表B-1提供了32种具有式I-B的化合物B-1.001至B-1.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0516] 表B-2提供了32种具有式I-B的化合物B-2.001至B-2.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0517] 表B-3提供了32种具有式I-B的化合物B-3.001至B-3.032, 其中A<sup>14</sup>是N, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>

是N,  $R^1$ 是H,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_2$ -环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0518] 表B-4提供了32种具有式I-B的化合物B-4.001至B-4.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是N,  $A^{34}$ 是N,  $R^1$ 是 $CH_3$ ,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_3$ 并且T是如表Z中所定义的。

[0519] 表B-5提供了32种具有式I-B的化合物B-5.001至B-5.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是N,  $A^{34}$ 是N,  $R^1$ 是 $CH_3$ ,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_2$ - $CF_2H$ 并且T是如表Z中所定义的。

[0520] 表B-6提供了32种具有式I-B的化合物B-6.001至B-6.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是N,  $A^{34}$ 是N,  $R^1$ 是 $CH_3$ ,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_2$ -环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0521] 表B-7提供了32种具有式I-B的化合物B-7.001至B-7.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是N,  $A^{34}$ 是N,  $R^1$ 是 $CH_2$ -环丙基,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_3$ 并且T是如表Z中所定义的。

[0522] 表B-8提供了32种具有式I-B的化合物B-8.001至B-8.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是N,  $A^{34}$ 是N,  $R^1$ 是 $CH_2$ -环丙基,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_2$ - $CF_2H$ 并且T是如表Z中所定义的。

[0523] 表B-9提供了32种具有式I-B的化合物B-9.001至B-9.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是N,  $A^{34}$ 是N,  $R^1$ 是 $CH_2$ -环丙基,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_2$ -环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0524] 表B-10提供了32种具有式I-B的化合物B-10.001至B-10.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是N,  $A^{34}$ 是CH,  $R^1$ 是H,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_3$ 并且T是如表Z中所定义的。

[0525] 表B-11提供了32种具有式I-B的化合物B-11.001至B-11.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是N,  $A^{34}$ 是CH,  $R^1$ 是H,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_2$ - $CF_2H$ 并且T是如表Z中所定义的。

[0526] 表B-12提供了32种具有式I-B的化合物B-12.001至B-12.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是N,  $A^{34}$ 是CH,  $R^1$ 是H,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_2$ -环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0527] 表B-13提供了32种具有式I-B的化合物B-13.001至B-13.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是N,  $A^{34}$ 是CH,  $R^1$ 是 $CH_3$ ,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_3$ 并且T是如表Z中所定义的。

[0528] 表B-14提供了32种具有式I-B的化合物B-14.001至B-14.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是N,  $A^{34}$ 是CH,  $R^1$ 是 $CH_3$ ,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_2$ - $CF_2H$ 并且T是如表Z中所定义的。

[0529] 表B-15提供了32种具有式I-B的化合物B-15.001至B-15.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是N,  $A^{34}$ 是CH,  $R^1$ 是 $CH_3$ ,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_2$ -环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0530] 表B-16提供了32种具有式I-B的化合物B-16.001至B-16.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是N,  $A^{34}$ 是CH,  $R^1$ 是 $CH_2$ -环丙基,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_3$ 并且T是如表Z中所定义的。

[0531] 表B-17提供了32种具有式I-B的化合物B-17.001至B-17.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是N,  $A^{34}$ 是CH,  $R^1$ 是 $CH_2$ -环丙基,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_2$ - $CF_2H$ 并且T是如表Z中所定义的。

[0532] 表B-18提供了32种具有式I-B的化合物B-18.001至B-18.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是N,  $A^{34}$ 是CH,  $R^1$ 是 $CH_2$ -环丙基,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_2$ -环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0533] 表B-19提供了32种具有式I-B的化合物B-19.001至B-19.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是CH,  $A^{34}$ 是N,  $R^1$ 是H,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_3$ 并且T是如表Z中所定义的。

[0534] 表B-20提供了32种具有式I-B的化合物B-20.001至B-20.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是CH,  $A^{34}$ 是N,  $R^1$ 是H,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_2$ - $CF_2H$ 并且T是如表Z中所定义的。

[0535] 表B-21提供了32种具有式I-B的化合物B-21.001至B-21.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是CH,  $A^{34}$ 是N,  $R^1$ 是H,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_2$ -环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0536] 表B-22提供了32种具有式I-B的化合物B-22.001至B-22.032, 其中 $A^{14}$ 是N,  $A^{24}$ 是CH,  $A^{34}$ 是N,  $R^1$ 是 $CH_3$ ,  $R^3$ 是 $CH_3$ ,  $R^{4c}$ 是 $CH_3$ 并且T是如表Z中所定义的。

[0537] 表B-23提供了32种具有式I-B的化合物B-23.001至B-23.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0538] 表B-24提供了32种具有式I-B的化合物B-24.001至B-24.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0539] 表B-25提供了32种具有式I-B的化合物B-25.001至B-25.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0540] 表B-26提供了32种具有式I-B的化合物B-26.001至B-26.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0541] 表B-27提供了32种具有式I-B的化合物B-27.001至B-27.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0542] 表B-28提供了32种具有式I-B的化合物B-28.001至B-28.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0543] 表B-29提供了32种具有式I-B的化合物B-29.001至B-29.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0544] 表B-30提供了32种具有式I-B的化合物B-30.001至B-30.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0545] 表B-31提供了32种具有式I-B的化合物B-31.001至B-31.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0546] 表B-32提供了32种具有式I-B的化合物B-32.001至B-32.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0547] 表B-33提供了32种具有式I-B的化合物B-33.001至B-33.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0548] 表B-34提供了32种具有式I-B的化合物B-34.001至B-34.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0549] 表B-35提供了32种具有式I-B的化合物B-35.001至B-35.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0550] 表B-36提供了32种具有式I-B的化合物B-36.001至B-36.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0551] 表B-37提供了32种具有式I-B的化合物B-37.001至B-37.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0552] 表B-38提供了32种具有式I-B的化合物B-38.001至B-38.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0553] 表B-39提供了32种具有式I-B的化合物B-39.001至B-39.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0554] 表B-40提供了32种具有式I-B的化合物B-40.001至B-40.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0555] 表B-41提供了32种具有式I-B的化合物B-41.001至B-41.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0556] 表B-42提供了32种具有式I-B的化合物B-42.001至B-42.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是

N, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0557] 表B-43提供了32种具有式I-B的化合物B-43.001至B-43.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0558] 表B-44提供了32种具有式I-B的化合物B-44.001至B-44.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0559] 表B-45提供了32种具有式I-B的化合物B-45.001至B-45.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0560] 表B-46提供了32种具有式I-B的化合物B-46.001至B-46.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0561] 表B-47提供了32种具有式I-B的化合物B-47.001至B-47.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0562] 表B-48提供了32种具有式I-B的化合物B-48.001至B-48.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0563] 表B-49提供了32种具有式I-B的化合物B-49.001至B-49.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0564] 表B-50提供了32种具有式I-B的化合物B-50.001至B-50.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0565] 表B-51提供了32种具有式I-B的化合物B-51.001至B-51.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0566] 表B-52提供了32种具有式I-B的化合物B-52.001至B-52.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0567] 表B-53提供了32种具有式I-B的化合物B-53.001至B-53.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0568] 表B-54提供了32种具有式I-B的化合物B-54.001至B-54.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是N, A<sup>34</sup>是CH, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0569] 表B-55提供了32种具有式I-B的化合物B-55.001至B-55.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0570] 表B-56提供了32种具有式I-B的化合物B-56.001至B-56.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0571] 表B-57提供了32种具有式I-B的化合物B-57.001至B-57.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是H, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0572] 表B-58提供了32种具有式I-B的化合物B-58.001至B-58.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0573] 表B-59提供了32种具有式I-B的化合物B-59.001至B-59.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0574] 表B-60提供了32种具有式I-B的化合物B-60.001至B-60.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0575] 表B-61提供了32种具有式I-B的化合物B-61.001至B-61.032, 其中A<sup>14</sup>是CH, A<sup>24</sup>是CH, A<sup>34</sup>是N, R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基, R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>, R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0576] 表B-62提供了32种具有式I-B的化合物B-62.001至B-62.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0577] 表B-63提供了32种具有式I-B的化合物B-63.001至B-63.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0578] 表B-64提供了32种具有式I-B的化合物B-64.001至B-64.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0579] 表B-65提供了32种具有式I-B的化合物B-65.001至B-65.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0580] 表B-66提供了32种具有式I-B的化合物B-66.001至B-66.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0581] 表B-67提供了32种具有式I-B的化合物B-67.001至B-67.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0582] 表B-68提供了32种具有式I-B的化合物B-68.001至B-68.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0583] 表B-69提供了32种具有式I-B的化合物B-69.001至B-69.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0584] 表B-70提供了32种具有式I-B的化合物B-70.001至B-70.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0585] 表B-71提供了32种具有式I-B的化合物B-71.001至B-71.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0586] 表B-72提供了32种具有式I-B的化合物B-72.001至B-72.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0587] 表B-73提供了32种具有式I-B的化合物B-73.001至B-73.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0588] 表B-74提供了32种具有式I-B的化合物B-74.001至B-74.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0589] 表B-75提供了32种具有式I-B的化合物B-75.001至B-75.032,其中A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0590] 表B-76提供了32种具有式I-B的化合物B-76.001至B-76.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0591] 表B-77提供了32种具有式I-B的化合物B-77.001至B-77.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0592] 表B-78提供了32种具有式I-B的化合物B-78.001至B-78.032,其中A<sup>14</sup>是CH,A<sup>24</sup>是N,A<sup>34</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0593] 表C-1至C-21(式I-C)

[0594] 表C-1提供了32种具有式I-C的化合物C-1.001至C-1.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0595] 表C-2提供了32种具有式I-C的化合物C-2.001至C-2.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0596] 表C-3提供了32种具有式I-C的化合物C-3.001至C-3.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0597] 表C-4提供了32种具有式I-C的化合物C-4.001至C-4.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0598] 表C-5提供了32种具有式I-C的化合物C-5.001至C-5.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0599] 表C-6提供了32种具有式I-C的化合物C-6.001至C-6.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0600] 表C-7提供了32种具有式I-C的化合物C-7.001至C-7.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0601] 表C-8提供了32种具有式I-C的化合物C-8.001至C-8.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0602] 表C-9提供了32种具有式I-C的化合物C-9.001至C-9.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0603] 表C-10提供了32种具有式I-C的化合物C-10.001至C-10.032,其中A<sup>14</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0604] 表C-11提供了32种具有式I-C的化合物C-11.001至C-11.032,其中A<sup>14</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0605] 表C-12提供了32种具有式I-C的化合物C-12.001至C-12.032,其中A<sup>14</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0606] 表C-13提供了32种具有式I-C的化合物C-13.001至C-13.032,其中A<sup>14</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0607] 表C-14提供了32种具有式I-C的化合物C-14.001至C-14.032,其中A<sup>14</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0608] 表C-15提供了32种具有式I-C的化合物C-15.001至C-15.032,其中A<sup>14</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0609] 表C-16提供了32种具有式I-C的化合物C-16.001至C-16.032,其中A<sup>14</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0610] 表C-17提供了32种具有式I-C的化合物C-17.001至C-17.032,其中A<sup>14</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0611] 表C-18提供了32种具有式I-C的化合物C-18.001至C-18.032,其中A<sup>14</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0612] 表C-19提供了32种具有式I-C的化合物C-19.001至C-19.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0613] 表C-20提供了32种具有式I-C的化合物C-20.001至C-20.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0614] 表C-21提供了32种具有式I-C的化合物C-21.001至C-21.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0615] 表D-1至D-21(式I-D)

[0616] 表D-1提供了32种具有式I-D的化合物D-1.001至D-1.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0617] 表D-2提供了32种具有式I-D的化合物D-2.001至D-2.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0618] 表D-3提供了32种具有式I-D的化合物D-3.001至D-3.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0619] 表D-4提供了32种具有式I-D的化合物D-4.001至D-4.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0620] 表D-5提供了32种具有式I-D的化合物D-5.001至D-5.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0621] 表D-6提供了32种具有式I-D的化合物D-6.001至D-6.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0622] 表D-7提供了32种具有式I-D的化合物D-7.001至D-7.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0623] 表D-8提供了32种具有式I-D的化合物D-8.001至D-8.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0624] 表D-9提供了32种具有式I-D的化合物D-9.001至D-9.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0625] 表D-10提供了32种具有式I-D的化合物D-10.001至D-10.032,其中A<sup>14</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0626] 表D-11提供了32种具有式I-D的化合物D-11.001至D-11.032,其中A<sup>14</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0627] 表D-12提供了32种具有式I-D的化合物D-12.001至D-12.032,其中A<sup>14</sup>是CH,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0628] 表D-13提供了32种具有式I-D的化合物D-13.001至D-13.032,其中A<sup>14</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0629] 表D-14提供了32种具有式I-D的化合物D-14.001至D-14.032,其中A<sup>14</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0630] 表D-15提供了32种具有式I-D的化合物D-15.001至D-15.032,其中A<sup>14</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0631] 表D-16提供了32种具有式I-D的化合物D-16.001至D-16.032,其中A<sup>14</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

[0632] 表D-17提供了32种具有式I-D的化合物D-17.001至D-17.032,其中A<sup>14</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>H并且T是如表Z中所定义的。

[0633] 表D-18提供了32种具有式I-D的化合物D-18.001至D-18.032,其中A<sup>14</sup>是CH,R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>-环丙基并且T是如表Z中所定义的。

[0634] 表D-19提供了32种具有式I-D的化合物D-19.001至D-19.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是H,R<sup>3</sup>是CH<sub>3</sub>,R<sup>4c</sup>是CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>并且T是如表Z中所定义的。

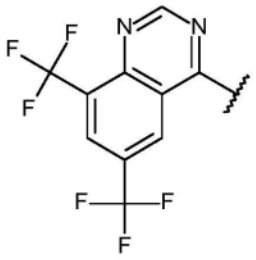
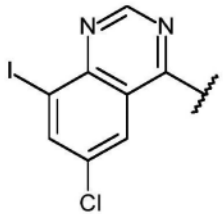
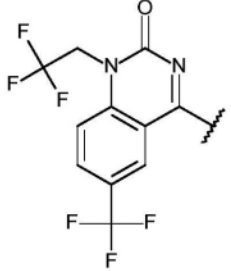
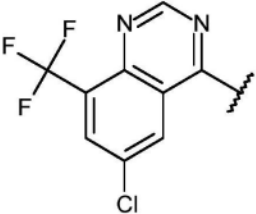
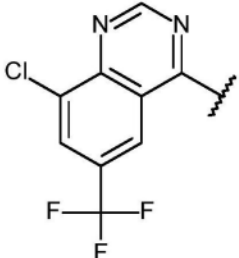
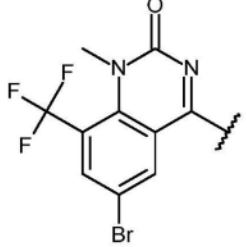
[0635] 表D-20提供了32种具有式I-D的化合物D-20.001至D-20.032,其中A<sup>14</sup>是N,R<sup>1</sup>是

$\text{CH}_3$ ,  $\text{R}^3$  是  $\text{CH}_3$ ,  $\text{R}^{4c}$  是  $\text{CH}_2\text{CH}_3$  并且 T 是如表 Z 中所定义的。

[0636] 表 D-21 提供了 32 种具有式 I-D 的化合物 D-21.001 至 D-21.032, 其中  $\text{A}^{14}$  是 N,  $\text{R}^1$  是  $\text{CH}_2$ -环丙基,  $\text{R}^3$  是  $\text{CH}_3$ ,  $\text{R}^{4c}$  是  $\text{CH}_2\text{CH}_3$  并且 T 是如表 Z 中所定义的。

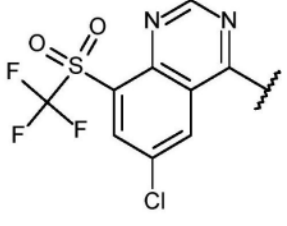
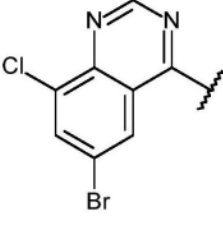
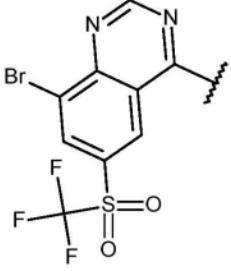
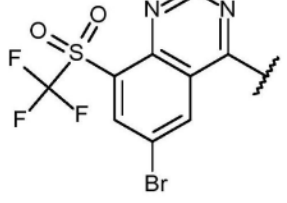
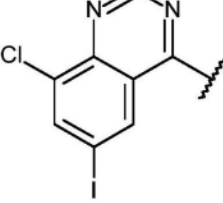
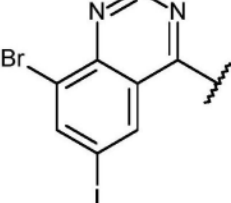
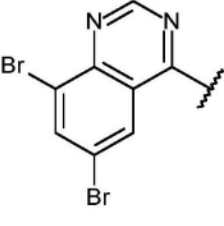
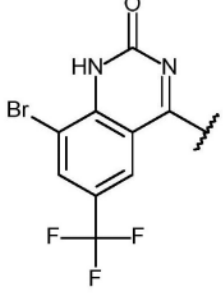
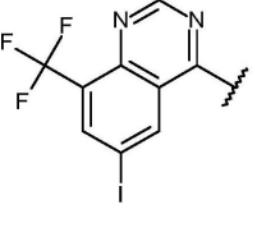
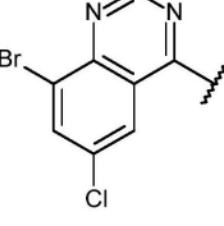
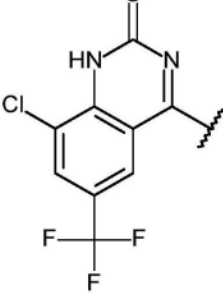
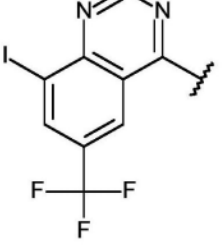
[0637] 表 Z: T 的取代基定义

[0638]

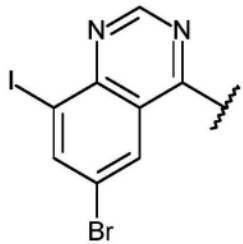
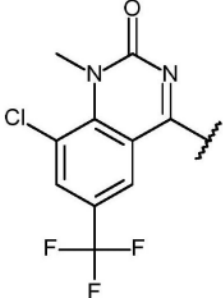
| 索引 | T                                                                                  | 索引 | T                                                                                   | 索引 | T                                                                                    |
|----|------------------------------------------------------------------------------------|----|-------------------------------------------------------------------------------------|----|--------------------------------------------------------------------------------------|
| 1  |   | 12 |   | 23 |   |
| 2  |  | 13 |  | 24 |  |

[0639]

| 索引 | T | 索引 | T | 索引 | T |
|----|---|----|---|----|---|
| 3  |   | 14 |   | 25 |   |
| 4  |   | 15 |   | 26 |   |
| 5  |   | 16 |   | 27 |   |
| 6  |   | 17 |   | 28 |   |

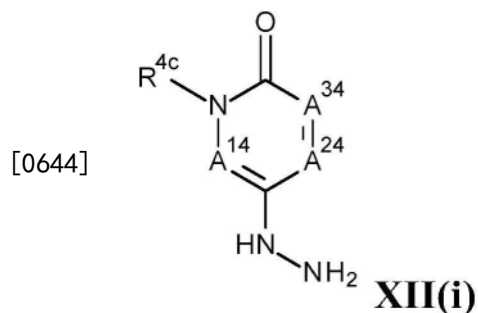
| 索引 | T                                                                                   | 索引 | T                                                                                    | 索引 | T                                                                                     |
|----|-------------------------------------------------------------------------------------|----|--------------------------------------------------------------------------------------|----|---------------------------------------------------------------------------------------|
| 7  |    | 18 |    | 29 |    |
| 8  |    | 19 |    | 30 |    |
| 9  |   | 20 |   | 31 |   |
| 10 |  | 21 |  | 32 |  |

[0640]

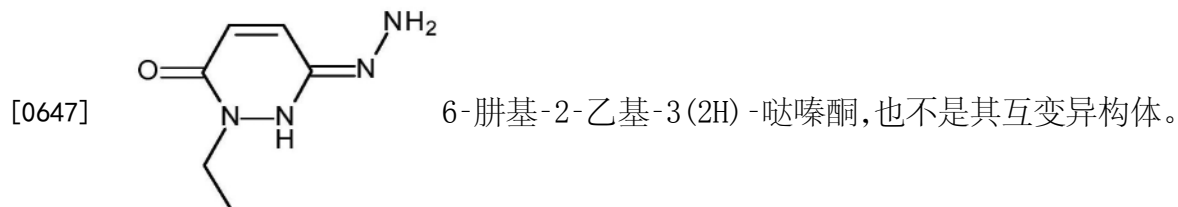
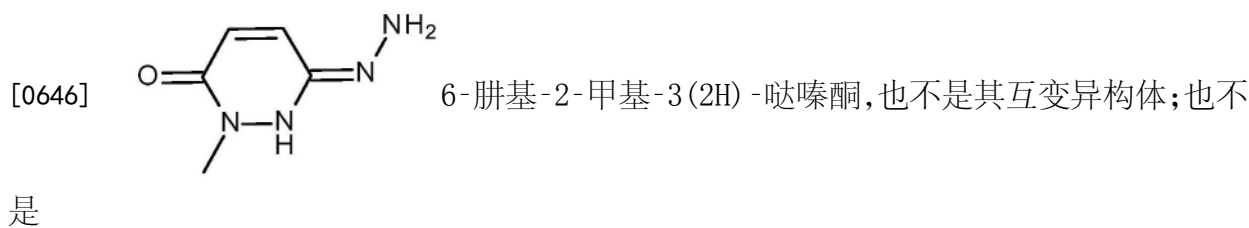
| 索引     | T                                                                                                                          | 索引 | T                                                                                                                           | 索引 | T |
|--------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----|---|
| [0641] | <div style="text-align: center;">  </div> | 22 | <div style="text-align: center;">  </div> | 33 |   |

[0642] 还使得可获得具有式II(i)、III(i)、IV(i)、IVa(i)、V(i)、VI(i)、VII(i)、VIII(i)、IX(i)、X(i)、XI(i)、XII(i)、XIV(i)、XV(i)、XVI(i)、XX(i)、XXI(i)、和XXII(i)的某些中间体化合物,其中的一些是新的。例如:

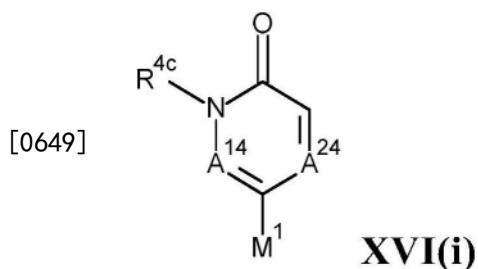
[0643] -具有式XII(i)的化合物或其互变异构体,或其盐:



[0645] 其中A<sup>14</sup>、A<sup>24</sup>、A<sup>34</sup>和R<sup>4c</sup>是如表A-1至A-78和表B-1至B-78中任一个中所定义的,前提是所述化合物不是



[0648] -具有式XVI(i)的化合物:



[0650] 其中A<sup>14</sup>和A<sup>24</sup>之一是N,另一个是CH,R<sup>4c</sup>是如表A-1至A-78和表B-1至B-78中任一个中所定义的,并且M<sup>1</sup>是含金属的取代基,例如硼取代基或锡取代基,如像三丁基甲锡烷基、二羟硼基或4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷-2-基,前提是所述具有式XVI(i)的化合物不是:

[0651] -2-甲基-6-三甲基甲锡烷基-哒嗪-3-酮(CAS 2254337-53-4),

[0652] -[5-氧代-4-(2,2,2-三氟乙基)吡嗪-2-基]硼酸(CAS 2509138-33-2),

[0653] -5-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷-2-基)-1-(2,2,2-三氟乙基)吡嗪-2-酮(CAS2509138-04-7),

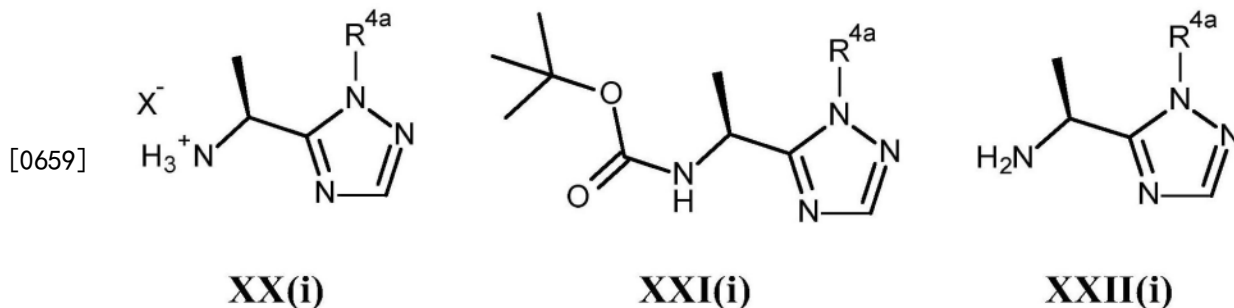
[0654] -(2-甲基-6-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷-2-基)哒嗪-3-酮(CAS1610374-18-9),

[0655] -2-异丙基-6-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷-2-基)哒嗪-3-酮(CAS2768712-84-9),

[0656] -(1-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基)硼酸(CAS1872185-45-9),也不是

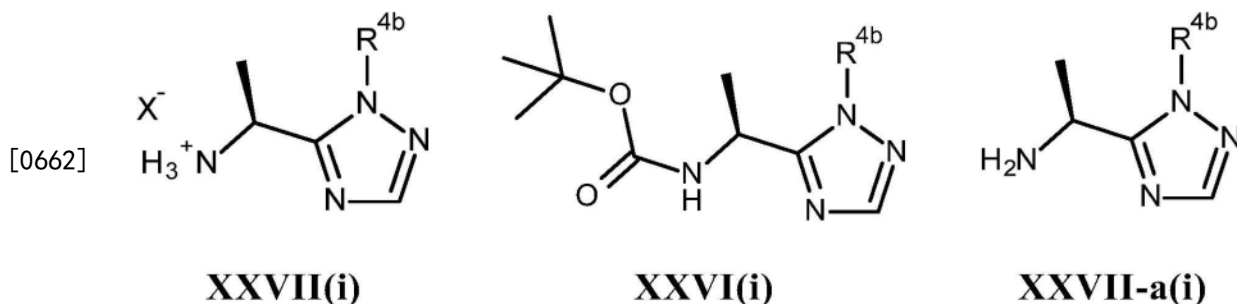
[0657] -(1-异丙基-6-氧代-哒嗪-3-基)硼酸(CAS2334476-21-8)。

[0658] -具有式XX(i)、XXI(i)和XXII(i)的化合物,



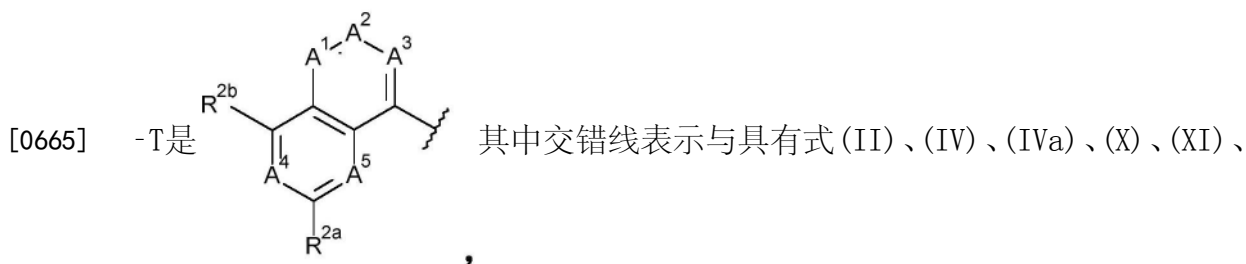
[0660] 其中R<sup>4a</sup>(包括A<sup>14</sup>、A<sup>24</sup>、A<sup>34</sup>和R<sup>4c</sup>)是如表A-1至A-78和表B-1至B-78中任一个中所定义的,并且其中X<sup>-</sup>是阴离子,即,阴离子X<sup>-</sup>是酸的共轭碱,该酸如无机酸,例如盐酸、氢溴酸、氟化氢、碘化氢、硫酸等,或有机酸,如羧酸或磺酸,例如三氟乙酸、甲磺酸或对甲苯磺酸。优选地A<sup>14</sup>是N,A<sup>24</sup>是CH,A<sup>34</sup>是CH并且R<sup>4c</sup>选自甲基或乙基,

[0661] -具有式XXVI(i)、XXVII(i)和XXVII-a(i)的化合物,



[0663] 其中 $R^{4b}$  (包括 $A^{14}$ 和 $R^{4c}$ ) 是如表C-1至C-21和表D-1至D-21中任一个中所定义的,并且其中 $X^-$  是阴离子,即,阴离子 $X^-$  是酸的共轭碱,该酸如无机酸,例如盐酸、氢溴酸、氟化氢、碘化氢、硫酸等,或有机酸,如羧酸或磺酸,例如三氟乙酸、甲磺酸或对甲苯磺酸。优选地 $A^{14}$  是N,并且 $R^{4c}$  选自甲基或乙基。

[0664] 在另一方面,本发明因此使得可获得具有式II (i)、III (i)、IV (i)、IVa (i)、V (i)、VI (i)、VII (i)、VIII (i)、IX (i)、X (i)、XI (i)、XII (i)、XIV (i)、XV (i)、XVI (i)、XX (i)、XXI (i)、和XXII (i) 的化合物,其中在每种情况下,在适用的情况下, $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $A^5$ 、 $X^0$ 、 $R^1$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ 、 $R^3$ 、 $Q^a$  (包括 $R^5$ 、 $R^{4c}$ 和 $R^4$ 作为 $R^{4a}$ 或 $R^{4b}$ )、 $Q^b$  (包括 $R^{5a}$ 、 $R^{5b}$ 、 $R^{4c}$ 和 $R^4$ 作为 $R^{4a}$ 或 $R^{4b}$ )、 $R^4$ 、 $R^{4a}$  (包括 $A^{14}$ 、 $A^{24}$ 、 $A^{34}$ 和 $R^{4c}$ )、 $R^{4b}$  (包括 $A^{14}$ 和 $R^{4c}$ )、 $R^X$ 、 $R^Y$ 和 $R^Z$ 是如在第一方面中对于式(I)所定义的,并且



(XVII) 的化合物的剩余部分的连接

[0666] -关于具有式II (i) 的化合物, $X^1$ 是离去基团,如卤素、羟基或磺酸酯,例如氯;

[0667] -关于具有式V (i) 的化合物, $X^2$ 是离去基团,如卤素 (例如氯或溴)、或磺酸酯 (例如甲磺酸酯);

[0668] -关于具有式VI (i) 的化合物, $X^3$ 是离去基团,如卤素 (例如氯、溴、碘)、或磺酸酯 (例如甲磺酸酯);

[0669] -关于具有式XV (i) 的化合物, $X^4$ 是离去基团,如像卤素 (例如氯)、磺酸酯、 $C_1$ - $C_4$ -硫烷基、 $C_1$ - $C_4$ -亚磺酰基或 $C_1$ - $C_4$ -磺酰基;

[0670] -关于具有式XVI (i) 的化合物, $M^1$ 是含金属的取代基,例如硼取代基或锡取代基,如像三丁基甲锡烷基、二羟硼基或4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷-2-基;

[0671] -关于具有式XX (i) 的化合物, $X^-$  是阴离子,即,酸的共轭碱,该酸如无机酸,例如盐酸、氢溴酸、氟化氢、碘化氢、硫酸等,或有机酸,如羧酸或磺酸,例如三氟乙酸、甲磺酸或对甲苯磺酸。

[0672] 此外,对于式(I)所示的对应实施例也适用于具有式II (i)、III (i)、IV (i)、IVa (i)、V (i)、VI (i)、VII (i)、VIII (i)、IX (i)、X (i)、XI (i)、XII (i)、XIV (i)、XV (i)、XVI (i)、XX (i)、XXI (i)、和XXII (i) 的化合物,如果适用的话。

[0673] 根据本发明的具有式(I) 的化合物在有害生物控制领域中是有预防和/或治疗价

值的活性成分,即使是在低的施用比率下,它们具有非常有利的杀生物谱并且是温血物种、鱼以及植物良好耐受的。根据本发明的这些活性成分作用于正常敏感的以及还有抗性的动物有害生物(如昆虫或蜱螨目的代表)的所有的或个别的发育阶段。根据本发明的活性成分的杀昆虫或杀螨活性可以本身直接显现出来,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。

[0674] 以上提及的动物有害生物的实例是:

[0675] 来自蜱螨目,例如,

[0676] 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.);

[0677] 来自虱目,例如,

[0678] 血虱属物种(*Haematopinus* spp.)、长颚虱属物种(*Linognathus* spp.)、人虱属物种(*Pediculus* spp.)、瘿绵蚜属物种(*Pemphigus* spp.)以及根瘤蚜属物种(*Phylloxera* spp.);

[0679] 来自鞘翅目,例如,

[0680] 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.)、鞘翅目虫属物种(*Eremnus* spp.)、黑异爪蔗金龟(*Heteronychus arator*)、咖啡果小蠹(*Hypothenemus hampei*)、长毛伪金花虫(*Lagria vilosa*)、马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata*)、稻水象属物种(*Lissorhoptrus* spp.)、利奥詹尼斯属物种(*Liogenys* spp.)、梅科拉普斯属物种(*Maecolaspis* spp.)、栗色绒金龟(*Maladera castanea*)、美洲叶甲属物种(*Megascelis* spp.)、油菜花露尾甲(*Meligethes aeneus*)、鳃金龟属物种(*Melolontha* spp.)、麦库阿玛

图斯 (*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.)、瑞索马图斯奥布提利斯 (*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.)；

[0681] 来自双翅目,例如,

[0682] 伊蚊属物种 (*Aedes* spp.)、疟蚊属物种 (*Anopheles* spp.)、高粱芒蚊 (*Antherigona soccata*)、橄榄果实蝇 (*Bactrocea oleae*)、花园毛蚊 (*Bibio hortulanus*)、迟眼蕈蚊属物种 (*Bradysia* spp.)、红头丽蝇 (*Calliphora erythrocephala*)、小条实蝇属物种 (*Ceratitis* spp.)、金蝇属物种 (*Chrysomya* spp.)、库蚊属物种 (*Culex* spp.)、黄蝇属物种 (*Cuterebra* spp.)、寡鬃实蝇属物种 (*Dacus* spp.)、地种蝇属物种 (*Delia* spp.)、黑腹果蝇 (*Drosophila melanogaster*)、厕蝇属物种 (*Fannia* spp.)、胃蝇属物种 (*Gastrophilus* spp.)、吉奥米扎三品他 (*Geomyza tripunctata*)、舌蝇属物种 (*Glossina* spp.)、皮蝇属物种 (*Hypoderma* spp.)、虱蝇属物种 (*Hyppobosca* spp.)、斑潜蝇属物种 (*Liriomyza* spp.)、绿蝇属物种 (*Lucilia* spp.)、黑潜蝇属物种 (*Melanagromyza* spp.)、家蝇属物种 (*Musca* spp.)、狂蝇属物种 (*Oestrus* spp.)、瘿蚊属物种 (*Orseolia* spp.)、瑞典麦秆蝇 (*Oscinella frit*)、藜泉蝇 (*Pegomyia hyoscyami*)、草种蝇属物种 (*Phorbia* spp.)、绕实蝇属物种 (*Rhagoletis* spp.)、瑞维拉四伐塞塔 (*Rivelia quadrifasciata*)、斯卡泰拉属物种 (*Scatella* spp.)、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.)；

[0683] 来自半翅目,例如,

[0684] 瘤缘蝽 (*Acanthocoris scabrator*)、拟缘蝽属物种 (*Acrosternum* spp.)、苜蓿盲蝽 (*Adelphocoris lineolatus*)、粉虱属物种 (*Aleurodes* spp.)、土黄缘蝽 (*Amblypelta nitida*)、海虾盾缘蝽 (*Bathypocheilus thalassina*)、土长蝽属物种、臭虫属物种、荚虫 (*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 histrionica*)、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.)、蒂亚塔属物种 (*Thyanta* spp.)、锥鼻虫属物种、木薯网蝽 (*Vatiga illudens*)；

[0685] 来自同翅目,例如,

[0686] 豌豆无网长管蚜 (*Acyrtosiphum pisum*)、阿达格 (*Adalges*) 属物种、阿加利亚纳恩西格拉 (*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、加斯卡迪亚(*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*)、莱格尼斯迈迪斯(*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、奥多纳斯吉拉斯(*Odonaspis ruthae*)、甘蔗棉蚜、杨梅缘粉虱、考氏木虱、片盾蚧属物种、瘿绵蚜属物种、玉米蜡蝉、扁角飞虱属物种、忽布疣蚜、根瘤蚜属物种(*Phylloxera spp.*)、动性球菌属物种、桑白盾蚧属物种、粉蚧属物种、棉跳盲蝽(*Pseudatomoscelis seriatus*)、木虱属物种、棉蚧(*Pulvinaria aethiopica*)、齿盾蚧属物种、奎萨达吉斯(*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、三迪克司博宝力(*Tridiscus sporoboli*)、葵粉蚧属物种(*Trionymus spp.*)、非洲木虱、矢尖蚧、火焰斑叶蝉、塞格达斯科瑞(*Zyginidia scutellaris*)；

[0687] 来自膜翅目,例如,

[0688] 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(*Solenopsis invicta*)、水蚁属物种(*Solenopsis spp.*)以及胡蜂属物种(*Vespa spp.*)；

[0689] 来自等翅目,例如,

[0690] 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*)

[0691] 来自鳞翅目(*Lepidoptera*),例如,

[0692] 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、南美玉米苗斑螟 (*Elasmopalpus lignosellus*)、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*)、豆荚斑螟 (*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、费提夹克粒非 (*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、拉马帕理思罗 (*Lasmopalpus lignosellus*)、旋纹潜叶蛾、潜叶细蛾属物种、葡萄花翅小卷蛾、罗斯蒂比富带 (*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、欧尼迪因地可 (*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；

[0693] 来自食毛目 (Mallophaga), 例如,

[0694] 畜虱属物种 (*Damalinea* spp.) 和啮毛虱属物种 (*Trichodectes* spp.);

[0695] 来自直翅目 (Orthoptera), 例如,

[0696] 螞属物种 (*Blatta* spp.)、小螞属物种 (*Blattella* spp.)、蝼蛄属物种 (*Gryllotalpa* spp.)、马德拉蜚螞 (*Leucophaea maderae*)、飞蝗属物种 (*Locusta* spp.)、北痣蟋蟀 (*Neocurtilla hexadactyla*)、大螞属物种 (*Periplaneta* spp.)、痣蟋蟀属物种 (*Scapteriscus* spp.)、以及沙漠蝗属物种 (*Schistocerca* spp.);

[0697] 来自啮虫目 (Psocoptera), 例如,

[0698] 虱啮属物种 (*Liposcelis* spp.);

[0699] 来自蚤目 (Siphonaptera), 例如,

[0700] 角叶蚤属物种 (*Ceratophyllus* spp.)、栉头蚤属物种 (*Ctenocephalides* spp.) 以及开皇客蚤 (*Xenopsylla cheopis*);

[0701] 来自缨翅目 (Thysanoptera), 例如,

[0702] 柯丽初菲斯力 (*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.);

[0703] 来自缨尾目 (Thysanura), 例如, 衣鱼 (*Lepisma saccharina*)。

[0704] 在另一方面中, 本发明还可涉及一种防治由植物寄生线虫 (内寄生线虫、半内寄生线虫和外寄生线虫) 对植物及其部分的损害的方法, 尤其是以下植物寄生线虫, 如根结线虫 (root knot nematodes)、北方根结线虫 (*Meloidogyne hapla*)、南方根结线虫 (*Meloidogyne incognita*)、爪哇根结线虫 (*Meloidogyne javanica*)、花生根结线虫 (*Meloidogyne arenaria*) 以及其他根结线虫属物种; 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; 禾谷胞囊线虫 (*Heterodera avenae*)、大豆胞囊线虫 (*Heterodera glycines*)、甜菜胞囊线虫 (*Heterodera schachtii*)、红三叶异皮线虫 (*Heterodera trifolii*)、以及其他异皮线虫属 (*Heterodera*) 物种; 种瘿线虫 (Seed gall nematodes)、粒线虫属 (*Anguina*) 物种; 茎及叶面线虫 (Stem and foliar nematodes)、滑刃线虫属 (*Aphelenchoides*) 物种; 刺毛线虫 (Sting nematodes)、长尾刺线虫 (*Belonolaimus longicaudatus*) 以及其他刺线虫属 (*Belonolaimus*) 物种; 松树线虫 (Pine nematodes)、松材线虫 (*Bursaphelenchus xylophilus*) 以及其他伞滑刃属 (*Bursaphelenchus*) 物种; 环形线虫 (Ring nematodes)、环线虫属 (*Criconema*) 物种、小环线虫属 (*Criconemella*) 物种、轮线虫属 (*Criconemoides*) 物种、中环线虫属 (*Mesocriconema*) 物种; 茎及鳞球茎线虫 (Stem and bulb nematodes)、腐烂茎线虫 (*Ditylenchus destructor*)、鳞球茎茎线虫 (*Ditylenchus dipsaci*) 以及其他茎线虫属 (*Ditylenchus*) 物种; 维线虫 (Awl nematodes)、锥线虫属 (*Dolichodorus*) 物种; 螺旋线虫 (Spiral nematodes)、多头螺旋线虫 (*Helicotylenchus multicinctus*) 以及其他螺旋线虫属 (*Helicotylenchus*) 物种; 鞘及鞘形线虫 (Sheath and sheathoid nematodes)、鞘线虫属 (*Hemicyclophora*) 物种以及半轮线虫属 (*Hemicriconemoides*) 物种; 潜根线虫属 (*Hirshmanniella*) 物种; 支线虫 (Lance nematodes)、冠线虫属 (*Hoploaimus*) 物种; 假根结线虫 (false rootknot nematodes)、珍珠线虫属 (*Nacobbus*) 物种; 针状线虫 (Needle nematodes)、横带长针线虫 (*Longidorus elongatus*) 以及其他长针线虫属 (*Longidorus*) 物种; 大头针线虫 (Pin nematodes)、短体线虫属 (*Pratylenchus*) 物种; 腐线虫 (Lesion nematodes)、花斑短体线虫 (*Pratylenchus neglectus*)、穿刺短体线虫 (*Pratylenchus penetrans*)、弯曲短体线虫 (*Pratylenchus curvatus*)、古氏短体线虫 (*Pratylenchus goodeyi*) 以及其他短体线虫属物种; 柑桔穿孔线虫 (Burrowing nematodes)、香蕉穿孔线虫 (*Radopholus similis*) 以及其他内侵线虫属 (*Radopholus*) 物种; 肾状线虫 (Reniform nematodes)、罗柏氏盘线虫 (*Rotylenchus robustus*)、肾形盘线虫 (*Rotylenchus reniformis*) 以及其他盘线虫属 (*Rotylenchus*) 物种; 盾线虫属 (*Scutellonema*) 物种; 短粗根线虫 (Stubby root nematodes)、原始毛刺线虫 (*Trichodorus primitivus*) 以及其他毛刺线虫属 (*Trichodorus*) 物种、拟毛刺线虫属 (*Paratrachodorus*) 物种; 矮化线虫 (Stunt nematodes)、马齿苋矮化线虫 (*Tylenchorhynchus claytoni*)、顺逆矮化线虫 (*Tylenchorhynchus dubius*) 以及其他矮化线虫属 (*Tylenchorhynchus*) 物种; 柑桔线虫 (Citrus nematodes)、穿刺线虫 (*Tylenchulus*) 物种; 短剑线虫 (Dagger nematodes)、剑线虫属 (*Xiphinema*) 物种; 以及其他植物寄生线虫物种, 如亚粒线虫属物种 (*Subanguina* spp.)、根结线虫属物种 (*Hypsoperine* spp.)、大刺环线虫属物种 (*Macroposthonia* spp.)、矮化线虫属物种 (*Melinius* spp.)、刻点胞囊属物种 (*Punctodera* spp.)、以及五沟线虫属物种 (*Quinisulcius* spp.)。

[0705] 本发明的化合物还可具有对抗软体动物的活性。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*)); 奥克洛迪纳 (*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*));由木非来(*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*);黑力扣迪斯克(*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*);小蛞蝓科(*Milax*) (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*)和扎尼托德斯(*Zanitoides*)。

[0706] 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。

[0707] 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、罂粟、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。

[0708] 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。

[0709] 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(*Anisodonte 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.tuberoux*))、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.maritima*))、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)、血菟属物种(*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。

[0710] 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、青葱(*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。

[0711] 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)。

[0712] 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)。

[0713] 具有式(I)的化合物特别适合于控制:

[0714] • 半翅目的有害生物,例如以下物种中的一种或多种:烟粉虱(*Bemisia tabaci*)、豆蚜、桃蚜、禾谷缢管蚜(*Rhopalosiphum Padi*)、褐稻虱(*Nilaparvata lugens*)、以及英雄美洲蟥(*Euschistus heros*) (优选在蔬菜、大豆、以及甘蔗上);

[0715] • 鳞翅目的有害生物,例如以下物种中的一种或多种:海灰翅夜蛾、草地贪夜蛾(*Spodoptera frugiperda*)、小菜蛾、稻纵卷叶螟(*Cnaphalocrocis medinalis*)、苹果蠹蛾、大豆尺蠖(*Chrysodeixis includes*)、二化螟、南美玉米苗斑螟(*Elasmopalpus lignosellus*)、大豆尺夜蛾(*Pseudoplusia includens*)、以及番茄斑潜蝇(优选在蔬菜和玉米上);

[0716] • 缨翅目的有害生物,如蓟马科,例如烟蓟马和西花蓟马中的一种或多种(优选在蔬菜上);以及

[0717] • (如鞘翅目的)土壤有害生物,例如物种黄瓜条叶甲、叩甲属物种以及马铃薯甲虫(优选在蔬菜和玉米上)。

[0718] 术语“作物”应当理解为还包括已经通过使用重组DNA技术而如此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。

[0719] 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 (*Photobacterium* spp.) 或致病杆菌属物种 (*Xenorhabdus* spp.), 如发光杆菌 (*Photobacterium luminescens*)、嗜线虫致病杆菌 (*Xenorhabdus nematophilus*); 由动物产生的毒素, 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, 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), 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、联苄合酶、几丁质酶和葡聚糖酶。

[0720] 在本发明的上下文中,  $\delta$ -内毒素, 例如 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1 或 Cry9C, 或营养期杀昆虫蛋白 (Vip), 例如 Vip1、Vip2、Vip3 或 Vip3A, 应理解为显然还包括混合型毒素、截短的毒素和经修饰的毒素。混合型毒素是通过那些蛋白质的不同结构域的新组合重组产生的 (参见例如, WO 02/15701)。截短的毒素, 例如截短的 Cry1Ab 是已知的。在经修饰的毒素的情况下, 天然存在的毒素的一个或多个氨基酸被替代。在这种氨基酸置换中, 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, 组织蛋白酶-G-识别序列被插入 Cry3A 毒素中 (参见 WO 03/018810)。

[0721] 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。

[0722] 用于制备此类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。

[0723] 包含在转基因植物中的毒素使得植物对有害昆虫有耐受性。这样的昆虫可以存在于任何昆虫分类群, 但尤其常见于甲虫 (鞘翅目)、双翅昆虫 (双翅目) 和蛾 (鳞翅目)。

[0724] 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的耐受性的酶膦丝菌素 N-乙酰基转移酶 (PAT)); **NuCOTN 33B®** (棉花品种, 表达 Cry1Ac 毒素); **Bollgard I®** (棉花品种, 表达 Cry1Ac 毒素); **Bollgard II®** (棉花品种, 表达 Cry1Ac 和 Cry2Ab 毒素); **VipCot®** (棉花品种, 表达 Vip3A 和 Cry1Ab 毒素); **NewLeaf®** (马铃薯品种, 表达 Cry3A 毒素); **NatureGard®**、**Agrisure® GT Advantage** (GA21 耐草甘膦性状)、**Agrisure® CB Advantage** (Bt11 玉米螟 (CB) 性状) 以及 **Protecta®**。

[0725] 此类转基因作物的另外的实例是:

[0726] 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。

[0727] 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的耐受性。

[0728] 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,登记号C/FR/96/05/10。通过转基因表达经修饰的Cry3A毒素使之具有昆虫抗性的玉米。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。

[0729] 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。

[0730] 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。

[0731] 6.1507玉米,来自先锋海外公司(Pioneer Overseas Corporation),特德斯科大道路(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铵膦的耐受性。

[0732] 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玉蜀黍转基因表达由土壤杆菌菌株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。

[0733] 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。

[0734] 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 353191是已知的。产生此类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上文提及的公开案中。

[0735] 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。

[0736] 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。

[0737] 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。

[0738] 可以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

钙通道阻断剂,例如病毒KP1、KP4或KP6毒素;芪合酶;联苄合酶;几丁质酶;葡聚糖酶;所谓的“病程相关蛋白”(PRP;参见例如EP-A-0 392 225);由微生物产生的抗病原物质,例如肽抗生素或杂环抗生素(参见例如WO 95/33818)或者参与植物病原体防御的蛋白质或多肽因子(所谓的“植物病害抗性基因”,如WO 03/000906中所述)。

[0739] 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。

[0740] 本发明提供了用于疗法的第一方面的化合物。本发明提供了第一方面的化合物,用于控制动物体内或体表的寄生虫。本发明进一步提供了第一方面的化合物,用于控制动物的体表寄生虫。本发明进一步提供了第一方面的化合物,用于预防和/或治疗由体表寄生虫传播的疾病。

[0741] 本发明提供了第一方面的化合物用于制造用于控制动物体内或体表的寄生虫的药物的用途。本发明进一步提供了第一方面的化合物用于制造用于控制动物的体表寄生虫的药物的用途。本发明进一步提供了第一方面的化合物用于制造用于预防和/或治疗由体表寄生虫传播的疾病的药物的用途。

[0742] 本发明提供了第一方面的化合物在控制动物体内或体表的寄生虫中的用途。本发明进一步提供了第一方面的化合物在控制动物的体表寄生虫中的用途。

[0743] 当在动物体内或体表的寄生虫的上下文中使用时,术语“控制”是指减少有害生物或寄生虫的数量,消除有害生物或寄生虫和/或防止进一步的有害生物或寄生虫感染。

[0744] 当在动物体内或体表的寄生虫的上下文中使用时,术语“治疗”是指抑制、减缓、停止或逆转现有症状或疾病的进展或严重性。

[0745] 当在动物体内或体表的寄生虫的上下文中使用时,术语“预防”是指避免在动物中发展症状或疾病。

[0746] 当在动物体内或体表的寄生虫的上下文中使用时,术语“动物”可能是指哺乳动物和非哺乳动物,如鸟或鱼。在哺乳动物的情况下,它可以是人类或非人类哺乳动物。非人类哺乳动物包括但不限于家畜动物和宠物。家畜动物包括但不限于牛、骆驼、猪、绵羊、山羊和马。宠物包括但不限于狗、猫和兔。

[0747] “寄生虫”是生活在宿主动物体内或体表并通过以宿主动物为代价获取营养物而受益的有害生物。“体内寄生虫”是生活在宿主动物体内的寄生虫。“体表寄生虫”是生活在宿主动物体表的寄生虫。体表寄生虫包括但不限于壁虱、昆虫和甲壳类动物(例如海虱)。壁虱(或蜱螨目)亚纲包括蜱和螨。蜱包括但不限于以下属的成员:扇头蜱属(*Rhipicaphalus*),例如微小扇头蜱(*Rhipicaphalus microplus*)(微小牛蜱(*Boophilus microplus*))和血红扇头蜱(*Rhipicephalus sanguineus*);花蜱属(*Amblyomrma*);革蜱属(*Dermacentor*);血蜱属(*Haemaphysalis*);璃眼蜱属(*Hyalomma*);硬蜱属(*Ixodes*);角头蜱属(*Rhipicentor*);牛壁虱属(*Margaropus*);锐缘蜱属(*Argas*);耳蜱属(*Otobius*);以及钝缘蜱属(*Ornithodoros*)。螨包括但不限于以下属的成员:皮螨属,例如牛皮痒螨;痒螨属,例如羊痒螨;姬螯螨属;皮刺螨属;例如鸡皮刺螨;禽刺螨属(*Ortnithonyssus*);蠕形螨属,例如犬蠕形螨;疥螨属,例如人疥螨;以及疮螨属。昆虫包括但不限于以下目的成员:蚤目、双翅目、毛虱目、鳞翅目、鞘翅目和同翅目。蚤目的成员包括但不限于猫栉头蚤和犬栉头蚤

(*Ctenocephatides canis*)。双翅目的成员包括但不限于蝇属物种；肤蝇，例如马蝇和羊狂蝇；螫蝇(biting flies)；虻，例如麻虻属物种和虻属(*Tabanus*)物种；黑角蝇属，例如扰血蝇；螫蝇属(*Stomoxys*)；绿蝇属；蠓；以及蚊。毛虱目类的成员包括但不限于吸血虱和嚼虱(chewing lice)，例如羊毛虱(*Bovicola Ovis*)和牛羽虱。

[0748] 当在动物体内或体表的寄生虫的上下文中使用时，术语“有效量”是指本发明化合物或其盐的量或剂量，其以单剂量或多剂量给予动物时，在动物体内或体表提供了希望的效果。主治诊断专家(作为本领域技术人员)通过使用已知技术和通过观察在类似情况下获得的结果，可以容易地确定有效量。在确定有效量时，主治诊断专家考虑了许多因素，包括但不限于：哺乳动物的种类；其大小、年龄和总体健康状况；要控制的寄生虫和侵染程度；所涉及的特定疾病或病症；疾病或病症的累及程度或严重性；个体反应；给予的特定化合物；给予模式；给予制剂的生物利用度特征；所选定的给药方案；伴随药物的使用；以及其他相关情况。

[0749] 本发明的化合物可以通过具有希望效果的任何途径给予动物，包括但不限于局部、口服、肠胃外和皮下。局部给予是优选的。适用于局部给予的配制品包括例如溶液、乳液和悬浮液，并且可以采取浇灌、点涂、喷涂、喷雾栏(spray race)或浸渍的形式。在替代方案中，本发明的化合物可以通过耳标或颈圈给予。

[0750] 本发明的化合物的盐形式包括药学上可接受的盐和兽医学上可接受的盐两者，它们可以不同于农用化学上可接受的盐。药学和兽医学上可接受的盐以及制备它们的常用方法在本领域中是熟知的。参见例如，Gould, P.L., "Salt selection for basic drugs[基础药物的盐选择]", *International Journal of Pharmaceutics*[国际药剂学杂志], 33:201-217 (1986); Bastin, R.J. 等人 "Salt Selection and Optimization Procedures for Pharmaceutical New Chemical Entities[制药新化学实体的盐选择和最优化程序]", *Organic Process Research and Development*[有机过程研究与开发], 4:427-435 (2000); 以及 Berge, S.M. 等人, "Pharmaceutical Salts[药用盐]", *Journal of Pharmaceutical Sciences*[药物科学杂志], 66:1-19, (1977)。合成领域的技术人员将理解，使用本领域普通技术人员熟知的技术和条件，本发明的化合物容易转化成盐，并且可以作为盐(如盐酸盐)分离。此外，合成领域的技术人员将理解，本发明的化合物容易转化成相应的游离碱，并且可以作为相应的游离碱从相应的盐中分离出来。

[0751] 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，该材料处于网织品、被覆物、被褥、窗帘以及帐篷的形式(或可以用于这些物品的制造中)。

[0752] 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，以便于在该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,以便于在该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,该基底是如处于网织品、被覆物、被褥、窗帘以及帐篷的形式(或可以用于这些物品的制造中)的织物材料。

[0753] 有待处理的基底(包括无纺布、织物或网织品)可以由天然纤维(如棉花、拉菲亚树叶纤维、黄麻、亚麻、剑麻、粗麻布或羊毛)或者合成纤维(如聚酰胺、聚酯、聚丙烯、聚丙烯腈等)制成。聚酯是特别适合的。纺织品处理的方法是已知的,例如WO 2008/151984、WO 2003/034823、US 5631072、WO 2005/64072、WO 2006/128870、EP 1724392、WO 2005113886或WO 2007/090739。

[0754] 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。

[0755] 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:

[0756] 表A.具有经济重要性的外来蛀木虫的实例。

| 科      | 种                                                | 受侵染的宿主或作物 |
|--------|--------------------------------------------------|-----------|
| 吉丁虫科   | 白蜡窄吉丁                                            | 白蜡木 (Ash) |
| 天牛科    | 光肩天牛                                             | 硬木        |
| [0757] | 粗穗赖草足距小蠹<br>( <i>Xylosandrus crassiusculus</i> ) | 硬木        |
|        | 削尾材小蠹                                            | 硬木        |
|        | 纵坑切梢小蠹                                           | 松柏类植物     |

[0758] 表B.具有经济重要性的本地蛀木虫的实例。

| 科      | 种                                | 受侵染的宿主或作物 |
|--------|----------------------------------|-----------|
| [0759] | 桦铜窄吉丁 ( <i>Agrilus anxius</i> )  | 桦树        |
|        | 磨光窄吉丁 ( <i>Agrilus politus</i> ) | 柳树、枫树     |
|        | 赛意窄吉丁 ( <i>Agrilus</i>           | 杨梅、香蕨木    |

[0760]

| 科   | 种                                             | 受侵染的宿主或作物                                                                                                                                                                |
|-----|-----------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|     | sayi)                                         |                                                                                                                                                                          |
|     | 维塔蒂科利斯窄吉丁<br>( <i>Agrilus vittaticollis</i> ) | 苹果树、梨树、蔓越橘、唐棣、山楂树                                                                                                                                                        |
|     | 苹扁头吉丁<br>( <i>Chrysobothris femorata</i> )    | 苹果、杏、山毛榉、白蜡木、樱桃树、栗树、红醋栗树、榆树、山楂树、朴树、山核桃树、欧洲七叶树、菩提树、枫树、欧洲花楸树、橡树、美洲山核桃树、梨树、桃树、柿子树、李子树、杨树、温柏、美国紫荆、唐棣、美国梧桐、核桃树、柳树                                                             |
|     | 野油菜得克萨那<br>( <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<br>( <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、 |

[0761]

| 科     | 种                                              | 受侵染的宿主或作物                                           |
|-------|------------------------------------------------|-----------------------------------------------------|
|       |                                                | 苹果树、榆树、菩提树、枫香                                       |
|       | 三线无花果天牛<br>( <i>Neoptychodes trilineatus</i> ) | 无花果树、赤杨木、桑树、柳树、网叶朴树 ( <i>Netleaf hackberry</i> )    |
|       | 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、英莲属、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<br>( <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<br>( <i>Saperda calcarata</i> )        | 杨树                                                  |
|       | 尼替斯特罗菲纳<br>( <i>Strophiona nitens</i> )        | 栗树、橡树、山核桃树、核桃树、山毛榉、枫树                               |
| 小 蠹 科 | 哥伦布小蠹 ( <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<br>( <i>Dendroctonus frontalis</i> )    | 松树                                                  |
|       | 美桦毛小蠹<br>( <i>Dryocoetes betulae</i> )         | 桦树、枫香、野樱桃树、山毛榉、梨树                                   |
|       | 黄带芳小蠹<br>( <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            |

| 科      | 种                                                | 受侵染的宿主或作物                                                        |
|--------|--------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------|
| [0762] | 桃鳃角小蠹<br>( <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                                      |
|        | 髯额小蠹<br>( <i>Pseudopityophthorus pruinosis</i> ) | 橡树、美国山毛榉木、黑樱桃树、契卡索李子树 ( <i>Chickasaw plum</i> )、栗树、枫树、山核桃树、角树、铁木 |
|        | 透翅蛾科                                             |                                                                  |
|        | 栋透翅蛾 ( <i>Paranthrene simulans</i> )             | 橡树、美洲栗树                                                          |
|        | 柿透翅蛾 ( <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                                              |
|        | 鲁布罗法克斯透翅蛾<br>( <i>Synanthedon rubrofascia</i> )  | 蓝果树                                                              |
|        | 瑞木透翅蛾<br>( <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、欧洲花楸树、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                                                              |

[0763] 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、蝼蛄、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。

[0764] 特别地,本发明可以用于控制摄食草坪草的根部的昆虫有害生物,包括蛴螬 (如圆头犀金龟属物种 (*Cyclocephala* spp.) (例如标记的金龟子、*C. lurida*)、棕色金龟子属物种 (*Rhizotrogus* spp.) (例如欧洲金龟子、欧洲切根鳃金龟 (*R. majalis*))、黄栌属物种 (例如

绿六月甲虫 (Green June beetle)、绿六月花金龟 (*C. nitida*)、弧丽金龟属物种 (*Popillia* spp.) (例如日本甲虫、日本弧丽金龟 (*P. japonica*))、鳃角金龟属物种 (*Phyllophaga* spp.) (例如五月/六月甲虫)、金龟属 (*Ataenius*) 物种 (例如草坪草黑金龟 (*Black turfgrass ataenius*)、黑绒金龟 (*A. spretulus*))、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 (*M. castanea*)) 以及托马雷斯属物种 (*Tomarus* spp.)、地面珍珠 (硕蛭属物种 (*Margarodes* spp.))、蝼蛄 (褐黄色的、南方的、以及短翅的；痣蟋蟀属物种 (*Scapteriscus* spp.)、非洲蝼蛄 (*Gryllotalpa africana*)) 以及大蚊幼虫 (leatherjackets) (欧洲大蚊 (*European crane fly*)、大蚊属物种 (*Tipula* spp.))。

[0765] 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 (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.)), 如猎食谷象 (*S. venatus vestitus*) 和牧草长喙象 (*S. parvulus*)) 以及草地螟 (如草螟属物种 (*Crambus* spp.) 和热带草地螟、*Herpetogramma phaeopteralis*)。

[0766] 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蟋 (如南方麦小蟋, 南方杆长蟋 (*Blissus insularis*))、狗牙根螨 (*Bermudagrass mite*) (*Eriophyes cynodonensis*)、盖氏虎尾草粉蚧 (草竹粉蚧 (*Antonina graminis*))、两线沫蝉 (*Prosapia bicincta*)、叶蝉、切根虫 (夜蛾科)、以及麦二叉蚜。

[0767] 本发明还可以用于控制草坪草中的其他有害生物, 如在草坪中创建蚁巢的外引红火蚁 (红火蚁 (*Solenopsis invicta*))。

[0768] 在卫生领域中, 根据本发明的组合物有效地对抗体表寄生虫如硬蜱、软蜱、疥螨、秋螨、蝇 (叮咬和舔舐)、寄生性蝇幼虫、虱、发虱、鸟虱和跳蚤。

[0769] 此类寄生虫的实例是:

[0770] 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 (*Phthirus* spp.)、管虱属物种。

[0771] 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、韦尼克拉 (*Werneckiella* spp.)、莱皮肯特伦属物种 (*Lepikentron* spp.)、畜虱属物种、啮毛虱属物种以及猫羽虱属物种 (*Felicola* spp.)。

[0772] 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.)、菲洛比米亚属物种 (*Philipomyia* spp.)、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 (*Chrysomya* 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.)和蜚蝇属物种(*Melophagus* spp.)，

[0773] 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，

[0774] 异翅目(Heteropterida)，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.)，

[0775] 蜚蠊目(Blattarida)，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.)。

[0776] 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.)。

[0777] 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(*L.氨基sioptes* spp.)。

[0778] 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、地板和建筑等的材料情况下免受昆虫侵染。

[0779] 根据本发明的组合物可用于，例如，对抗以下有害生物：甲虫，如北美家天牛(*Hylotrupes bajulus*)、长毛天牛(*Chlorophorus pilosis*)、家具窃蠹(*Anobium punctatum*)、红毛窃蠹(*Xestobium rufovillosum*)、梳角细脉窃蠹(*Ptilinuspecticornis*)、*Dendrobium pertinex*、松芽枝窃蠹(*Ernobius mollis*)、*Priobium carpini*、褐粉蠹(*Lyctus brunneus*)、非洲粉蠹(*Lyctus africanus*)、南方粉蠹(*Lyctus planicollis*)、栎粉蠹(*Lyctus linearis*)、柔毛粉蠹(*Lyctus pubescens*)、胸粉蠹(*Trogxylon aequale*)、鳞毛粉蠹(*Minthesrugicollis*)、材小蠹属物种(*Xyleborus spec.*)、条木小蠹属物种(*Tryptodendron spec.*)、咖啡黑长蠹(*Apate monachus*)、槲长蠹(*Bostrychus capucins*)、棕异翅长蠹(*Heterobostrychus brunneus*)、双棘长蠹属物种(*Sinoxylon spec.*)以及竹长蠹(*Dinoderus minutus*)，以及还有膜翅类，如蓝黑树蜂

(*Sirex juvencus*)、大树蜂(*Urocerus gigas*)、泰加大树蜂(*Urocerus gigas taignus*)和 *Urocerus augu*,以及白蚁类,如欧洲木白蚁(*Kaloterms flavicollis*)、麻头堆砂白蚁(*Cryptoterms brevis*)、印巴结构木异白蚁(*Heteroterms indicola*)、黄胸散白蚁(*Reticulitermes flavipes*)、桑特散白蚁(*Reticulitermes santonensis*)、欧洲散白蚁(*Reticulitermes lucifugus*)、达尔文澳白蚁(*Mastoterms darwiniensis*)、内华达古白蚁(*Zootermopsis nevadensis*)与家白蚁,以及蛀虫,如衣鱼(*Lepisma saccharina*)。

[0780] 具有式(I)和(I')的化合物或其盐尤其适用于控制选自以下科的一种或多种有害生物:夜蛾科、菜蛾科、叶甲科、蓟马科、蜡科、卷蛾科、飞虱科、蚜科、夜蛾科、草螟科、根结线虫科和异皮线虫科。在每个方面的优选实施例中,化合物TX(其中缩写“TX”意指“选自表A-1至A-78、B-1至B-78、C-1至C-21和D-1至D-21中所定义的化合物的一种化合物”)控制选自以下科的有害生物中的一种或多种:夜蛾科、菜蛾科、叶甲科、蓟马科、蜡科、卷蛾科、飞虱科、蚜科、夜蛾科、草螟科、根结线虫科和异皮线虫科。

[0781] 具有式(I)和(I')的化合物或其盐尤其适用于控制选自以下属的有害生物中的一种或多种:灰翅夜蛾属物种、菜蛾属物种、花蓟马属物种、蓟马属物种、美洲蜡属物种、小卷蛾属物种、褐飞虱属物种、桃蚜属物种、蚜虫属物种、条叶甲属物种、缢管蚜属物种、尺夜蛾属物种和禾草螟属物种。在每个方面的优选实施例中,化合物TX(其中缩写“TX”意指“选自表A-1至A-78、B-1至B-78、C-1至C-21和D-1至D-21中所定义的化合物的一种化合物”)控制选自以下属的有害生物中的一种或多种:灰翅夜蛾属物种、菜蛾属物种、花蓟马属物种、蓟马属物种、美洲蜡属物种、小卷蛾属物种、褐飞虱属物种、桃蚜属物种、蚜虫属物种、条叶甲属物种、缢管蚜属物种、尺夜蛾属物种和禾草螟属物种。

[0782] 具有式(I)和(I')的化合物或其盐尤其适用于控制以下项的一种或多种:海灰翅夜蛾、小菜蛾、西花蓟马、烟蓟马、英雄美洲蜡、苹果蠹蛾、褐稻虱、桃蚜、大豆尺蠖、豆蚜、黄瓜条叶甲、禾谷缢管蚜、和二化螟。

[0783] 在每个方面的优选实施例中,化合物TX(其中缩写“TX”意指“选自表A-1至A-78、B-1至B-78、C-1至C-21和D-1至D-21中所定义的化合物的一种化合物”)控制以下中的一种或多种:海灰翅夜蛾、小菜蛾、西花蓟马、烟蓟马、英雄美洲蜡、苹果蠹蛾、褐稻虱、桃蚜、大豆尺蠖、豆蚜、黄瓜条叶甲、禾谷缢管蚜、以及二化螟,如海灰翅夜蛾+TX、小菜蛾+TX;西花蓟马+TX、烟蓟马+TX、英雄美洲蜡+TX、苹果蠹蛾+TX、褐稻虱+TX、桃蚜+TX、大豆尺蠖+TX、豆蚜+TX、黄瓜条叶甲+TX、禾谷缢管蚜+TX、和二化螟+TX。

[0784] 在每个方面的实施例中,来自表A-1至A-78、B-1至B-78、C-1至C-21和D-1至D-21的一种化合物适用于控制棉花、蔬菜、玉米、谷类、水稻以及大豆作物上的海灰翅夜蛾、小菜蛾、西花蓟马、烟蓟马、英雄美洲蜡、苹果蠹蛾、褐稻虱、桃蚜、大豆尺蠖、豆蚜、黄瓜条叶甲、禾谷缢管蚜、以及二化螟。

[0785] 在实施例中,来自表A-1至A-78、B-1至B-78、C-1至C-21和D-1至D-21的一种化合物适用于控制甘蓝夜蛾属(优选地在蔬菜上)、苹果蠹蛾(优选地在苹果上)、小绿叶蝉属(优选地在蔬菜、葡萄园里)、叶甲属(优选地在马铃薯上)以及二化螟(优选地在水稻上)。

[0786] 根据本发明的化合物可以具有任何数量的益处,尤其包括针对保护植物对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(对地上和地下的非靶标生物体(如鱼、鸟和蜂))、改进的

物理-化学特性、或增加的生物可降解性)。特别地,已经出人意料地发现某些具有式(I)的化合物相对于非靶标节肢动物,特别是传粉者(如蜜蜂、独居蜂和熊蜂),可以显示出有利的安全性。最特别地,相对于意大利蜂(*Apis mellifera*)。

[0787] 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、水包油乳液、可流动油、水性分散体、油性分散体、悬乳液、胶囊悬浮液、可乳化的颗粒剂、可溶性液体、水可溶性浓缩物(以水或水混溶性有机溶剂作为载体)、浸渍的聚合物膜或处于已知的其他形式,例如从Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides[关于杀有害生物剂的FAO和WHO标准的发展和使用的手册],联合国,第1版,二次修订(2010)中已知的。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。

[0788] 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、分散体或乳液形式的组合物。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。

[0789] 这些活性成分还可以被包含于非常精细的微胶囊中。微胶囊在多孔载体中含有活性成分。这使得活性成分能够以受控的量释放(例如,缓慢释放)到环境中。微胶囊通常具有从0.1至500微米的直径。它们包含的活性成分的量按重量计是胶囊重量的约从25%至95%。这些活性成分可以处于整体性的固体的形式、处于固体或液体分散体中的精细颗粒的形式或处于适合溶液的形式。包裹的膜可以包含例如天然的或合成的橡胶、纤维素、苯乙烯/丁二烯共聚物、聚丙烯腈、聚丙烯酸酯、聚酯、聚酰胺、聚脲、聚氨酯或化学改性的聚合物以及淀粉黄原酸酯、或本领域的技术人员已知的其他聚合物。可替代地,可以形成非常精细的微胶囊,其中活性成分在基础物质的固体基质中是以精细分散颗粒的形式被包含的,但这些微胶囊本身未经包裹。

[0790] 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。

[0791] 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。

[0792] 许多表面活性物质可以有利地用在固体和液体配制品两者中,尤其是在使用前可被载体稀释的那些配制品中。表面活性物质可以是阴离子的、阳离子的、非离子的或聚合的并且它们可以用作乳化剂、湿润剂或悬浮剂或用于其他目的。典型的表面活性物质包括例如烷基硫酸酯的盐,如十二烷基硫酸二乙醇铵;烷基芳基磺酸酯的盐,如十二烷基苯磺酸钙;烷基酚/氧化烯加成产物,如乙氧基化壬基苯酚;醇/氧化烯加成产物,如乙氧基化十三烷醇;皂,如硬脂酸钠;烷基萘磺酸酯的盐,如二丁基萘磺酸钠;磺基琥珀酸二烷基酯的盐,如二(2-乙基己基)磺基琥珀酸钠;山梨糖醇酯,如山梨糖醇油酸酯;季铵,如氯化十二烷基三甲基铵;脂肪酸的聚乙二醇酯,如聚乙二醇硬脂酸酯;环氧乙烷和环氧丙烷的嵌段共聚物;以及磷酸单烷基酯和二烷基酯的盐;以及还有另外的物质,例如描述于:McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual[麦卡琴清洁剂和乳化剂年鉴],MC出版公司(MC Publishing Corp.),里奇伍德,新泽西州(Ridgewood New Jersey)(1981)。

[0793] 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。

[0794] 根据本发明的组合物可以包括添加剂,该添加剂包括植物或动物来源的油、矿物油、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该待施用的混合物的从0.01%到10%。例如,可以在喷雾混合物已经制备之后将该油添加剂以所希望的浓度添加到喷雾罐中。优选的油添加剂包括矿物油或植物来源的油,例如菜籽油、橄榄油或葵花籽油;乳化的植物油;植物来源的油的烷基酯,例如甲基衍生物;或动物来源的油,如鱼油或牛脂。优选的油添加剂包括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。

[0795] 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,该配制辅助剂优选地包括按重量计从0至25%的表面活性物质。而商业产品可以优选地被配制为浓缩物,最终使用者将通常使用稀释配制品。

[0796] 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。

[0797] 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)、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。

[0798] 优选的配制品可以具有以下组成(重量%)：

[0799] 可乳化浓缩物：

[0800] 活性成分：1%至95%，优选60%至90%

[0801] 表面活性剂：1%至30%，优选5%至20%

[0802] 液体载体：1%至80%，优选1%至35%

[0803] 尘粉剂：

[0804] 活性成分：0.1%至10%，优选0.1%至5%

[0805] 固体载体：99.9%至90%，优选99.9%至99%

[0806] 悬浮液浓缩物：

[0807] 活性成分：5%至75%，优选10%至50%

[0808] 水：94%至24%，优选88%至30%

[0809] 表面活性剂：1%至40%，优选2%至30%

[0810] 可湿性粉剂：

[0811] 活性成分：0.5%至90%，优选1%至80%

[0812] 表面活性剂：0.5%至20%，优选1%至15%

[0813] 固体载体：5%至95%，优选15%至90%

[0814] 颗粒剂：

[0815] 活性成分：0.1%至30%，优选0.1%至15%

[0816] 固体载体：99.5%至70%，优选97%至85%

[0817] 具有式(I)的化合物与活性成分的以下混合物是优选的(其中缩写“TX”意指“选自表A-1至A-78、B-1至B-78、C-1至C-21和D-1至D-21、以及表P中所定义的化合物的一种化合物”)：

[0818] 辅助剂，其选自由以下组成的物质组：石油(别名)(628)+TX；

[0819] 阿维菌素+TX、灭螨醌+TX、啉虫脒+TX、乙酰虫脒+TX、氟丙菊酯+TX、阿西诺阿皮(acynonapyr)+TX、双丙环虫酯+TX、阿福拉纳(afoxolaner)+TX、棉铃威+TX、丙烯除虫菊酯+TX、 $\alpha$ -氯氰菊酯+TX、甲体氯氰菊酯+TX、磺胺螨酯+TX、灭害威+TX、三唑锡+TX、杀虫磺+TX、苯螨特+TX、苯吡莫烷(benzpyrimoxan)+TX、 $\beta$ -氟氯氰菊酯+TX、 $\beta$ -氯氰菊酯+TX、联苯肼酯+TX、联苯菊酯+TX、乐杀螨+TX、生物烯丙菊酯+TX、S-生物烯丙菊酯+TX、生物苧呋菊酯+TX、双三氟虫脒+TX、溴虫氟苯双酰胺(broflanilide)+TX、溴氟菊酯+TX、溴硫磷-乙基+TX、噻嗪酮+TX、丁酮威+TX、硫线磷+TX、西维因+TX、丁硫克百威+TX、巴丹+TX、CAS号：1632218-00-8+TX、CAS号：1808115-49-2+TX、CAS号：2032403-97-5+TX、CAS号：2044701-44-0+TX、CAS号：2128706-05-6+TX、CAS号：2095470-94-1+TX、CAS号：2377084-09-6+TX、CAS号：1445683-71-5+TX、CAS号：2408220-94-8+TX、CAS号：2408220-91-5+TX、CAS号：1365070-72-9+TX、CAS号：2171099-09-3+TX、CAS号：2396747-83-2+TX、CAS号：2133042-31-4+TX、CAS号：2133042-44-9+TX、CAS号：1445684-82-1+TX、CAS号：1445684-82-1+TX、CAS号：1922957-45-6+TX、CAS号：1922957-46-7+TX、CAS号：1922957-47-8+TX、CAS号：1922957-48-9+TX、CAS号：2415706-16-8+TX、CAS号：1594624-87-9+TX、CAS号：1594637-65-6+TX、CAS号：1594626-19-3+TX、CAS号：

1990457-52-7+TX、CAS号:1990457-55-0+TX、CAS号:1990457-57-2+TX、CAS号:1990457-77-6+TX、CAS号:1990457-66-3+TX、CAS号:1990457-85-6+TX、CAS号:2220132-55-6+TX、CAS号:1255091-74-7+TX、CAS号:RNA(马铃薯甲虫-特异性重组双链干扰GS2)+TX、CAS号:2719848-60-7+TX、CAS号:1956329-03-5+TX、氯虫苯甲酰胺+TX、氯丹+TX、溴虫腈+TX、氯炔丙菊酯+TX、环虫酰肼+TX、克仑吡林+TX、除线威(cloethocarb)+TX、噻虫胺+TX、2-氯苯基N-甲基氨基甲酸酯(CPMC)+TX、苯腈磷+TX、溴氰虫酰胺+TX、环溴虫酰胺+TX、环丁氟仑(cyclobutrifluram)+TX、拟除虫菊酯+TX、环氧虫啉+TX、腈吡螨酯+TX、乙唑螨腈(cyetypyrafen)(或乙唑螨腈(etpyrafen))+TX、丁氟螨酯+TX、氟氯氰菊酯+TX、氯氟氰虫酰胺(cyhalodiamide)+TX、三氟氯氰菊酯+TX、氯氰菊酯+TX、苯氰菊酯+TX、环丙氟虫胺(cyproflanimide)+TX、灭蝇胺+TX、溴氰菊酯+TX、杀螨隆+TX、氯亚胺硫磷+TX、二溴磷(dibrom)+TX、二氯噻吡嘧啉(dicloromezotiaz)+TX、氟螨啉+TX、除虫脲+TX、噻虫啉酰胺(dimpropyridaz)+TX、二活菌素+TX、敌螨普+TX、呋虫胺+TX、蔬果磷+TX、埃玛菌素(或埃玛菌素苯甲酸盐)+TX、右旋烯炔菊酯+TX、ε-莫氟菊酯(epsilon-momfluorothrin)+TX、ε-甲氧苄氟菊酯+TX、高氰戊菊酯+TX、乙硫磷+TX、乙虫腈+TX、醚菊酯+TX、乙螨唑+TX、伐灭磷+TX、啉螨醚+TX、五氟苯菊酯+TX、丰迷唑迪缇亚兹(fenmezoditiaz)+TX、杀螟硫磷+TX、仲丁威+TX、苯硫威+TX、苯氧威+TX、甲氰菊酯+TX、啉螨酯(fenpyroximate)+TX、丰索磷+TX、倍硫磷+TX、叶塞灵+TX、氰戊菊酯+TX、氟虫腈+TX、氟麦托醌(flometoquin)+TX、氟啉虫酰胺+TX、啉螨酯+TX、三氟咪啉酰胺(fluzaindolizine)+TX、啉蜱脲+TX、氟虫双酰胺+TX、氟螨啉+TX、氟氯虫双酰胺(fluchlordiniliprole)+TX、氟西特纳特(flucitrinate)+TX、氟螨脲+TX、氟氰戊菊酯+TX、氟噻虫砒+TX、啉虫胺+TX、三氟醚菊酯+TX、丁烯氟虫腈+TX、氟己芬(fluhexafon)+TX、氟氯苯菊酯+TX、氟吡菌酰胺+TX、氟苯硫奥芬诺克斯(flupentiofenox)+TX、氟吡呋喃酮+TX、氟吡明(flupyrimin)+TX、氟雷拉纳(fluralaner)+TX、氟胺氰菊酯+TX、氟艾米特米德(fluxametamide)+TX、噻唑膦+TX、γ-三氟氯氰菊酯+TX、戊吡虫脲+TX、氯虫酰肼+TX、苄螨醚+TX、七氟甲醚菊酯(heptafluthrin)+TX、噻螨酮+TX、氟蚁脲+TX、咪唑环磷(imicyafos)+TX、吡虫啉+TX、炔咪菊酯+TX、吡达扎吡罗萨米特(indazapyroxamet)+TX、茚虫威+TX、碘甲烷+TX、异菌脲+TX、异噁唑虫酰胺(isocycloseram)+TX、异拌磷+TX、伊维菌素+TX、κ-联苯菊酯+TX、κ-七氟菊酯+TX、λ-三氟氯氰菊酯+TX、雷皮菌素+TX、洛替拉纳(lotilaner)+TX、氯芬奴隆+TX、氰氟虫脲+TX、四聚乙醛+TX、威百亩+TX、灭多虫+TX、甲氧虫酰肼+TX、甲氧苄氟菊酯+TX、速灭威+TX、自克威+TX、灭螨菌素+TX、莫氟菊酯(momfluorothrin)+TX、灭绦灵+TX、尼克氟普罗(nicofluprole)+TX;烯啉虫胺+TX、硝虫噻啉+TX、氧乐果+TX、杀线威+TX、Oxazosulfonyl+TX、对硫磷-乙基+TX、苄氯菊酯+TX、苯醚菊酯+TX、磷虫威+TX、胡椒基丁醚+TX、抗蚜威+TX、啉啉磷-乙基+TX、啉啉磷-甲基+TX、多角体病毒+TX、炔丙菊酯+TX、丙溴磷+TX、丙氟菊酯+TX、克螨特+TX、胺丙畏+TX、残杀威+TX、丙硫磷+TX、丙苯炔菊酯(Protrifenbute)+TX、吡氟丁酰胺(Pyflubumide)+TX、吡蚜酮+TX、吡啉硫磷+TX、啉吡啉虫胺(Pyrafluprole)+TX、啉螨灵+TX、啉虫丙醚+TX、氟虫吡啉(Pyrifluquinazon)+TX、啉螨醚+TX、啉螨胺+TX、吡啉虫啉+TX、蚊蝇醚+TX、苄呋菊酯+TX、Sarolaner+TX、司拉克丁(Selamectin)+TX、氟硅菊酯+TX、乙基多杀菌素+TX、多杀菌素+TX、spirobudifen+TX、螺螨酯+TX、螺甲螨酯+TX、Spiropidion+TX、螺虫乙酯+TX、spidoxamat+TX、砒虫啉+TX、虫酰肼+TX、吡螨胺+TX、丁基啉啉磷(Tebupirimiphos)+TX、七氟菊酯+TX、双

硫磷+TX、四氯虫酰胺+TX、四氯杀螨砒 (Tetradiphen) +TX、胺菊酯+TX、四氟醚菊酯+TX、杀螨素+TX、氟氰虫酰胺+TX、 $\theta$ -氯氰菊酯+TX、噻虫啉+TX、噻虫嗪+TX、杀虫环+TX、硫双威+TX、久效威+TX、甲基乙拌磷+TX、杀虫单+TX、tigolaner+TX、tiorantraniliprole+TX、Tioxazafen+TX、唑虫酰胺+TX、毒杀芬+TX、四溴菊酯+TX、四氟苯菊酯+TX、唑蚜威+TX、三唑磷+TX、敌百虫+TX、trifluenfurionate+TX、毒壤磷+TX、敌百虫+TX、三氟苯嘧啶 (Triflumezopyrim) +TX、Tyclopyrazoflor+TX、 $\zeta$ -氯氰菊酯+TX、海藻提取物和衍生自糖酰的发酵产物+TX、海藻提取物和衍生自糖酰的发酵产物 (包含脲+TX、氨基酸+TX、钾和钼以及EDTA螯合锰) +TX、海藻提取物和发酵的植物产物+TX、海藻提取物和发酵的植物产物 (包含植物激素+TX、维生素+TX、EDTA螯合铜+TX、锌+TX、以及铁+TX)、印楝素+TX、芽孢杆菌属鮈泽 (*Bacillus aizawai*) +TX、蚀几丁质芽孢杆菌 (*Bacillus chitinosporus*) AQ746 (NRRL登记号B-21 618)+TX、坚强芽孢杆菌+TX、芽孢杆菌属库尔斯塔克 (*Bacillus kurstaki*) +TX、蕈状芽孢杆菌AQ726 (NRRL登记号B-21664)+TX、短小芽孢杆菌 (NRRL登记号B-30087)+TX、短小芽孢杆菌AQ717 (NRRL登记号B-21662)+TX、芽孢杆菌属物种AQ178 (ATCC登记号53522)+TX、芽孢杆菌属物种AQ175 (ATCC登记号55608)+TX、芽孢杆菌属物种AQ177 (ATCC登记号55609)+TX、未指明的枯草芽孢杆菌+TX、枯草芽孢杆菌AQ153 (ATCC登记号55614)+TX、枯草芽孢杆菌AQ30002 (NRRL登记号B-50421)+TX、枯草芽孢杆菌AQ30004 (NRRL登记号B-50455)+TX、枯草芽孢杆菌AQ713 (NRRL登记号B-21661)+TX、枯草芽孢杆菌AQ743 (NRRL登记号B-21665)+TX、苏云金芽孢杆菌AQ52 (NRRL登记号B-21619)+TX、苏云金芽孢杆菌BD#32 (NRRL登记号B-21530)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种 (subspec. *kurstaki*) BMP 123+TX、球孢白僵菌+TX、D-柠檬烯+TX、颗粒体病毒+TX、康壮素 (Harpin) +TX、棉铃虫核型多角体病毒+TX、谷实夜蛾核型多角体病毒+TX、烟芽夜蛾核型多角体病毒+TX、澳洲棉铃虫核型多角体病毒+TX、绿僵菌属物种+TX、*Muscodor albus* 620 (NRRL登记号30547)+TX、*Muscodor roseus* A3-5 (NRRL登记号30548)+TX、基于印楝树的产品+TX、玫烟色拟青霉+TX、淡紫色拟青霉+TX、拟斯扎瓦巴氏杆菌+TX、穿刺巴氏杆菌+TX、分枝巴氏杆菌+TX、索雷巴氏杆菌 (*Pasteuria thornei*) +TX、巴氏杆菌+TX、对-伞花炔+TX、小菜蛾颗粒体病毒+TX、小菜蛾核型多角体病毒+TX、多角体病毒+TX、除虫菊+TX、QRD 420 (类萜共混物)+TX、QRD 452 (类萜共混物)+TX、QRD 460 (类萜共混物)+TX、皂树+TX、球状红球菌AQ719 (NRRL登记号B-21663)+TX、草地贪夜蛾核型多角体病毒+TX、鲜黄链霉菌 (NRRL登记号30232)+TX、链霉菌属物种 (NRRL登记号B-30145)+TX、类萜共混物+Tx、以及轮枝孢属物种+TX;

[0820] 杀藻剂,其选自由以下组成的物质组:百杀辛 (bethoxazin) [CCN]+TX、二辛酸铜 (IUPAC名称) (170)+TX、硫酸铜 (172)+TX、cybutryne [CCN]+TX、二氯萘醌 (dichlone) (1052)+TX、双氯酚 (232)+TX、茵多酸 (295)+TX、三苯锡 (fentin) (347)+TX、熟石灰 [CCN]+TX、代森钠 (nabam) (566)+TX、灭藻醌 (quinoclamine) (714)+TX、醌苄胺 (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;

[0821] 驱蠕虫剂,其选自由以下组成的物质组:阿维菌素 (1)+TX、克芦磷酯 (1011)+TX、Cyclobutrifluram+TX、多拉克汀 (别名) [CCN]+TX、埃玛菌素 (291)+TX、埃玛菌素苯甲酸酯 (291)+TX、依立诺克丁 (别名) [CCN]+TX、伊维菌素 (别名) [CCN]+TX、米尔贝肟 (milbemycin oxime) (别名) [CCN]+TX、莫昔克丁 (别名) [CCN]+TX、哌嗪 [CCN]+TX、司拉克丁 (别名) [CCN]+TX、多杀菌素 (737) 和托布津 (thiophanate) (1435)+TX;

[0822] 杀鸟剂,其选自由以下组成的物质组:氯醛糖(127)+TX、异狄氏剂(1122)+TX、倍硫磷(346)+TX、吡啶-4-胺(IUPAC名称)(23)和士的宁(745)+TX;

[0823] 杀细菌剂,其选自由以下组成的物质组:1-羟基-1H-吡啶-2-硫酮(IUPAC名称)(1222)+TX、4-(喹啉-2-基氨基)苯磺酰胺(IUPAC名称)(748)+TX、8-羟基喹啉硫酸盐(446)+TX、溴硝醇(97)+TX、二辛酸铜(IUPAC名称)(170)+TX、氢氧化铜(IUPAC名称)(169)+TX、甲酚[CCN]+TX、双氯酚(232)+TX、双吡硫翁(1105)+TX、多地辛(1112)+TX、敌磺钠(fen氨基sulf)(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;

[0824] 生物试剂,其选自由以下组成的物质组:棉褐带卷蛾GV(别名)(12)+TX、放射形土壤杆菌(别名)(13)+TX、钝绥螨属物种(*Amblyseius* spp.) (别名)(19)+TX、芹菜夜蛾NPV(别名)(28)+TX、原樱翅缨小蜂(*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、食蚜瘿蚊(*Aphidoletes aphidimyza*) (别名)(35)+TX、苜蓿银纹夜蛾NPV(别名)(38)+TX、坚强芽孢杆菌(*Bacillus firmus*) (别名)(48)+TX、球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus* Neide) (学名)(49)+TX、苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis* Berliner) (学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌鮎泽亚种(*Bacillus thuringiensis* subsp.aizawai) (学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌以色列亚种(*Bacillus thuringiensis* subsp.israelensis) (学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌日本亚种(*Bacillus thuringiensis* subsp.japonensis) (学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(*Bacillus thuringiensis* subsp.kurstaki) (学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种(*Bacillus thuringiensis* subsp.tenebrionis) (学名)(51)+TX、球孢白僵菌(*Beauveria bassiana*) (别名)(53)+TX、布氏白僵菌(*Beauveria brongniartii*) (别名)(54)+TX、普通草蛉(*Chrysoperla carnea*) (别名)(151)+TX、孟氏隐唇瓢虫(*Cryptolaemus montrouzieri*) (别名)(178)+TX、苹果蠹蛾GV(别名)(191)+TX、西伯利亚离颚茧蜂(*Dacnusa sibirica*) (别名)(212)+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂(*Diglyphus isaea*) (别名)(254)+TX、丽蚜小蜂(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 riobravus* (别名) (742)+TX、螻蛄斯氏线虫 (*Steinernema scapterisci*) (别名) (742)+TX、斯氏线虫属物种 (*Steinernema* spp.) (别名) (742)+TX、赤眼蜂属物种 (别名) (826)+TX、西方盲走螨 (*Typhlodromus occidentalis*) (别名) (844) 和蜡蚧轮枝菌 (*Verticillium lecanii*) (别名) (848)+TX;

[0825] 土壤消毒剂,其选自由以下组成的物质组:碘甲烷 (IUPAC名称) (542) 和溴甲烷 (537)+TX;

[0826] 化学不育剂,其选自由以下组成的物质组:啉磷嗪 (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、甲基啉磷嗪 (methyl apholate) [CCN]+TX、不孕啉 (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;

[0827] 昆虫信息素,其选自由以下组成的物质组:(E)-癸-5-烯-1-基乙酸酯与(E)-癸-5-烯-1-醇 (IUPAC名称) (222)+TX、(E)-十三碳-4-烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名称) (829)+TX、(E)-6-甲基庚-2-烯-4-醇 (IUPAC名称) (541)+TX、(E,Z)-十四碳-4,10-二烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名称) (779)+TX、(Z)-十二碳-7-烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名称) (285)+TX、(Z)-十六碳-11-烯醛 (IUPAC名称) (436)+TX、(Z)-十六碳-11-烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名称) (437)+TX、(Z)-十六碳-13-烯-11-炔-1-基乙酸酯 (IUPAC名称) (438)+TX、(Z)-二十-13-烯-10-酮 (IUPAC名称) (448)+TX、(Z)-十四碳-7-烯-1-醛 (IUPAC名称) (782)+TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-醇 (IUPAC名称) (783)+TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名称) (784)+TX、(7E,9Z)-十二碳-7,9-二烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名称) (283)+TX、(9Z,11E)-十四碳-9,11-二烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名称) (780)+TX、(9Z,12E)-十四碳-9,12-二烯-1-基乙酸酯 (IUPAC名称) (781)+TX、14-甲基十八碳-1-烯 (IUPAC名称) (545)+TX、4-甲基壬-5-醇与4-甲基壬-5-酮 (IUPAC名称) (544)+TX、 $\alpha$ -多纹素 (multistriatin) (别名) [CCN]+TX、西部松小蠹集合信息素 (brevicomin) (别名) [CCN]+TX、十二碳二烯醇 (codlelure) (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、**Gossyplure®** (别名;十六烷-7,11-二烯-1-基-乙酸酯的(Z,E)和(Z,Z)异构体的1:1混合物) (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、醋酸十六烯酯 (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、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、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、特诱酮(839)+TX、特诱酮A(别名) (839)+TX、特诱酮B<sub>1</sub>(别名) (839)+TX、特诱酮B<sub>2</sub>(别名) (839)+TX、特诱酮C(别名) (839)和trunc-call(别名) [CCN]+TX;

[0828] 昆虫驱避剂,其选自由以下组成的物质组:2-(辛基硫代)乙醇(IUPAC名称) (591)+TX、避蚊酮(butopyronoxyl) (933)+TX、丁氧基(聚丙二醇) (936)+TX、己二酸二丁酯(IUPAC名称) (1046)+TX、邻苯二甲酸二丁酯(1047)+TX、丁二酸二丁酯(IUPAC名称) (1048)+TX、避蚊胺[CCN]+TX、驱蚊灵(dimethyl carbate) [CCN]+TX、邻苯二甲酸二甲酯[CCN]+TX、乙基己二醇(1137)+TX、己脲[CCN]+TX、甲喹丁(methoquin-butyl) (1276)+TX、甲基新癸酰胺[CCN]+TX、草氨酸盐(oxamate) [CCN]和派卡瑞丁[CCN]+TX;

[0829] 杀软体动物剂,其选自由以下组成的物质组:二(三丁基锡)氧化物(IUPAC名称) (913)+TX、溴乙酰胺[CCN]+TX、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;

[0830] 杀线虫剂,其选自由以下组成的物质组:AKD-3088(化合物代码)+TX、1,2-二溴-3-氯丙烷(IUPAC/化学文摘名称) (1045)+TX、1,2-二氯丙烷(IUPAC/化学文摘名称) (1062)+TX、1,2-二氯丙烷与1,3-二氯丙烯(IUPAC名称) (1063)+TX、1,3-二氯丙烯(233)+TX、3,4-二氯四氢噻吩1,1-二氧化物(IUPAC/化学文摘名称) (1065)+TX、3-(4-氯苯基)-5-甲基罗丹宁(IUPAC名称) (980)+TX、5-甲基-6-硫代-1,3,5-噻二嗪-3-基乙酸(IUPAC名称) (1286)+TX、6-异戊烯基氨基嘌呤(别名) (210)+TX、阿维菌素(1)+TX、乙酰虫脒[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、丁基吡螨灵(别名)+TX、克线丹(109)+TX、克百威(carbofuran) (118)+TX、二硫化碳(945)+TX、丁硫克百威(119)+TX、氯化苦(141)+TX、毒死蜱(145)+TX、除线威(999)+TX、Cyclobutirifluram+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、氟噻虫砜(flusulfone)[318290-98-1]+TX、氟吡菌酰胺+TX;

[0831] 硝化抑制剂,其选自由以下组成的物质组:乙基黄原酸钾[CCN]以及氯啶(nitrapyrin)(580)+TX;

[0832] 植物活化剂,其选自由以下组成的物质组:阿拉酸式苯(acibenzolar)(6)+TX、阿拉酸式苯-S-甲基(6)+TX、噻菌灵(probenazole)(658)和大虎杖(*Reynoutria sachalinensis*)提取物(别名)(720)+TX;

[0833] 杀鼠剂,其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-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(包括 $\alpha$ -溴敌隆)+TX、溴鼠胺(92)+TX、氰化钙(444)+TX、氯醛糖(127)+TX、氯鼠酮(140)+TX、胆钙化醇(别名)(850)+TX、氯灭鼠灵(1004)+TX、克灭鼠(1005)+TX、杀鼠萘(175)+TX、杀鼠嘧啶(1009)+TX、鼠得克(246)+TX、噻鼠灵(249)+TX、敌鼠(273)+TX、钙化醇(301)+TX、氟鼠灵(357)+TX、氟乙酰胺(379)+TX、氟鼠啶(1183)+TX、氟鼠啶盐酸盐(1183)+TX、 $\gamma$ -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;

[0834] 增效剂,其选自由以下组成的物质组:2-(2-丁氧基乙氧基)乙基胡椒酸酯(IUPAC名称)(934)+TX、5-(1,3-苯并间二氧杂环戊烯-5-基)-3-己基环己-2-烯酮(IUPAC名称)(903)+TX、具有橙花叔醇的法呢醇(别名)(324)+TX、MB-599(研究代码)(498)+TX、MGK 264(研究代码)(296)+TX、增效醚(piperonyl butoxide)(649)+TX、增效醛(piprotal)(1343)+TX、增效酯(propyl isomer)(1358)+TX、S421(研究代码)(724)+TX、增效散(sesamex)(1393)+TX、芝麻林素(sesamol)(1394)和亚砷(1406)+TX;

[0835] 动物驱避剂,其自由以下组成的物质组:蒽醌(32)+TX、氯醛糖(127)+TX、环烷酸铜[CCN]+TX、王铜(171)+TX、二嗪磷(227)+TX、二环戊二烯(化学名称)(1069)+TX、双胍辛盐(guazatine)(422)+TX、双胍辛乙酸盐(422)+TX、灭虫威(530)+TX、吡啶-4-胺(IUPAC名称)(23)+TX、塞仑(804)+TX、混杀威(trimethacarb)(840)+TX、环烷酸锌[CCN]和福美锌(856)+TX;

[0836] 杀病毒剂,其选自由以下组成的物质组:衣马宁(别名)[CCN]和利巴韦林(别名)[CCN]+TX;

[0837] 创伤保护剂,其选自由以下组成的物质组:氧化汞(512)+TX、辛噻酮(octhilinone)(590)和甲基托布津(802)+TX;

[0838] 生物活性物质,其选自1,1-双(4-氯苯基)-2-乙氧基乙醇+TX、2,4-二氯苯基苯磺酸酯+TX、2-氟-N-甲基-N-1-萘乙酰胺+TX、4-氯苯基苯基砒+TX、乙酰虫腈+TX、涕灭砒威+TX、赛果+TX、果满磷+TX、胺吸磷+TX、草酸氢胺吸磷+TX、双甲脒+TX、杀螨特+TX、三氧化二砷+TX、偶氮苯+TX、偶氮磷+TX、苯菌灵+TX、苯诺沙磷(benoxafos)+TX、苯甲酸苄酯+TX、联苯吡菌胺+TX、溴灭菊酯+TX、溴烯杀+TX、溴硫磷+TX、溴螨酯+TX、噻嗪酮+TX、丁酮威+TX、丁酮砒威+TX、丁基吡螨灵+TX、多硫化钙+TX、八氯苡烯+TX、氯灭杀威+TX、三硫磷+TX、螨婢胺+TX、灭螨猛+TX、杀螨醚+TX、杀虫脒+TX、杀虫脒盐酸盐+TX、杀螨醇+TX、杀螨酯+TX、敌螨特+TX、乙酯杀螨醇+TX、灭螨脒(chloromebuform)+TX、灭虫脒+TX、丙酯杀螨醇+TX、虫螨磷+TX、瓜菊酯I+TX、瓜菊酯II+TX、瓜菊酯+TX、克罗散泰+TX、蝇毒磷+TX、克罗米通+TX、巴毒磷+TX、硫杂灵+TX、果虫磷+TX、DCPM+TX、DDT+TX、田乐磷+TX、田乐磷-0+TX、田乐磷-S+TX、内吸磷-甲基+TX、内吸磷-0+TX、内吸磷-0-甲基+TX、内吸磷-S+TX、内吸磷-S-甲基+TX、磺吸磷(demeton-S-methylsulfon)+TX、抑菌灵+TX、敌敌畏+TX、二克磷+TX、除螨灵+TX、甲氟磷+TX、消螨酚(dinex)+TX、消螨酚(dinex-diclexine)+TX、敌螨普-4+TX、敌螨普-6+TX、邻敌螨消+TX、硝戊酯+TX、硝辛酯杀螨剂+TX、硝丁酯+TX、敌杀磷+TX、磺基二苯+TX、戒酒硫+TX、DNOC+TX、苯氧炔螨(dofenapyn)+TX、多拉克汀+TX、因毒磷+TX、依立诺克丁+TX、益硫磷+TX、乙嘧硫磷+TX、抗螨唑+TX、苯丁锡+TX、苯硫威+TX、fenpyrad+TX、唑螨酯+TX、胺苯吡菌酮+TX、除螨酯+TX、氟硝二苯胺(fentrifanil)+TX、氟螨噻+TX、氟螨脒+TX、联氟螨+TX、氟杀螨+TX、FMC 1137+TX、伐虫脒+TX、伐虫脒盐酸盐+TX、胺甲威(formparanate)+TX、 $\gamma$ -HCH+TX、果绿定+TX、苄螨醚+TX、十六烷基环丙烷羧酸酯+TX、水胺硫磷+TX、茉莉菊酯I+TX、茉莉菊酯II+TX、碘硫磷+TX、林丹+TX、丙螨氰+TX、灭蚜磷+TX、二噻磷+TX、甲硫芬+TX、虫螨畏+TX、溴甲烷+TX、速灭威+TX、自克威+TX、米尔贝肟+TX、丙胺氟+TX、久效磷+TX、茂果+TX、莫昔克丁+TX、二溴磷(naled)+TX、4-氯-2-(2-氯-2-甲基-丙基)-5-[(6-碘-3-吡啶基)甲氧基]哒嗪-3-酮+TX、氟蚁灵+TX、尼可霉素+TX、戊氰威+TX、戊氰威1:1氯化锌络合物+TX、氧乐果+TX、亚异砒磷+TX、砒拌磷+TX、pp'-DDT+TX、对硫磷+TX、苄氯菊酯+TX、芬硫磷+TX、伏杀磷+TX、硫环磷+TX、磷胺+TX、氯化松节油(polychloroterpenes)+TX、杀螨素(polynactins)+TX、丙氯诺+TX、婢虱威+TX、残杀威+TX、乙噻唑磷+TX、发硫磷+TX、除虫菊酯I+TX、除虫菊酯II+TX、除虫菊酯+TX、哒嗪硫磷+TX、嘧硫磷+TX、喹硫磷(quinalphos)+TX、喹硫磷(quintiofos)+TX、R-1492+TX、甘氨硫磷+TX、鱼藤酮+TX、八甲磷+TX、克线丹+TX、司拉克丁+TX、苏硫磷+TX、SSI-121+TX、舒非仑+TX、氟虫胺+TX、硫特普+TX、硫+TX、氟螨嗪+TX、 $\tau$ -氟胺氰菊酯+TX、TEPP+TX、叔丁威+TX、四氯杀螨砒+TX、杀螨好+TX、thiafenox+TX、抗虫威+TX、久效威+TX、甲基乙拌磷+TX、克杀螨+TX、苏力菌素+TX、威菌磷+TX、苯螨噻+TX、三唑磷+TX、唑呀威+TX、三氯丙氧磷+TX、三活菌素+TX、蚜灭多+TX、甲烯氟虫腈(vaniliprole)+TX、百杀辛+TX、二辛酸铜+TX、硫酸铜+TX、cybutryne+TX、二氯萘醌+TX、双氯酚+TX、茵多酸+TX、三苯锡+TX、熟石灰+TX、代森钠+TX、灭藻醌+TX、醌苄胺+TX、西玛津+TX、三苯基乙酸锡+TX、三苯基氢氧化锡+TX、育畜磷+TX、哌嗪+TX、托布津+TX、氯醛糖+TX、倍硫磷+TX、吡啶-4-胺+TX、土的宁+TX、1-羟基-1H-吡啶-2-硫酮+TX、4-(喹啉-2-基氨基)苯磺酰胺+TX、8-羟基喹啉硫酸盐+TX、溴硝醇+TX、氢氧化铜+TX、甲酚+TX、双吡硫翁+TX、多地辛+TX、敌磺钠+TX、甲醛+TX、汞加芬+TX、春雷霉素+TX、春雷霉素盐酸盐水合物+TX、二(二甲基二硫代氨基甲酸)镍+TX、三氯甲基吡啶+TX、辛噻酮+TX、奥索利酸+TX、土霉素+TX、羟基喹啉硫酸钾+TX、噻菌灵+TX、链霉素+TX、链霉素倍半

硫酸盐+TX、叶枯酞+TX、硫柳汞+TX、棉褐带卷蛾GV+TX、放射形土壤杆菌+TX、钝绥螨属物种+TX、芹菜夜蛾NPV+TX、原樱翅缨小蜂+TX、短距蚜小蜂+TX、棉蚜寄生蜂+TX、食蚜瘿蚊+TX、苜蓿银纹夜蛾NPV+TX、球形芽孢杆菌+TX、布氏白僵菌+TX、普通草蛉+TX、孟氏隐唇瓢虫+TX、苹果蠹蛾GV+TX、西伯利亚离颚茧蜂+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂+TX、丽蚜小蜂+TX、桨角蚜小蜂+TX、嗜菌异小杆线虫和大异小杆线虫+TX、斑长足瓢虫+TX、橘粉介壳虫寄生蜂+TX、盲蝽+TX、甘蓝夜蛾NPV+TX、黄阔柄跳小蜂+TX、黄绿绿僵菌+TX、金龟子绿僵菌小孢变种+TX、欧洲新松叶蜂NPV和红头新松叶蜂NPV+TX、小花蝽属物种+TX、玫烟色拟青霉+TX、智利小植绥螨+TX、毛蚊线虫+TX、小卷蛾斯氏线虫+TX、夜蛾斯氏线虫+TX、格氏线虫+TX、锐比斯氏线虫+TX、Steinernema riobravis+TX、蝼蛄斯氏线虫+TX、斯氏线虫属物种+TX、赤眼蜂属物种+TX、西方盲走螨+TX、蜡蚧轮枝菌+TX、唑磷嗉+TX、双(氮丙啶)甲氨基膦硫化物+TX、白消安+TX、迪麦替夫+TX、六甲蜜胺+TX、六甲磷+TX、甲基涕巴+TX、甲硫涕巴+TX、甲基唑磷嗉+TX、不孕啶+TX、氟幼脲+TX、涕巴+TX、硫代六甲磷+TX、硫涕巴+TX、曲他胺+TX、尿烷亚胺+TX、(E)-癸-5-烯-1-基乙酸酯与(E)-癸-5-烯-1-醇+TX、(E)-十三碳-4-烯-1-基乙酸酯+TX、(E)-6-甲基庚-2-烯-4-醇+TX、(E,Z)-十四碳-4,10-二烯-1-基乙酸酯+TX、(Z)-十二碳-7-烯-1-基乙酸酯+TX、(Z)-十六碳-11-烯醛+TX、(Z)-十六碳-11-烯-1-基乙酸酯+TX、(Z)-十六碳-13-烯-11-炔-1-基乙酸酯+TX、(Z)-二十-13-烯-10-酮+TX、(Z)-十四碳-7-烯-1-醛+TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-醇+TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-基乙酸酯+TX、(7E,9Z)-十二碳-7,9-二烯-1-基乙酸酯+TX、(9Z,11E)-十四碳-9,11-二烯-1-基乙酸酯+TX、(9Z,12E)-十四碳-9,12-二烯-1-基乙酸酯+TX、14-甲基十八碳-1-烯+TX、4-甲基壬-5-醇与4-甲基壬-5-酮+TX、 $\alpha$ -多纹素+TX、西部松小蠹集合信息素+TX、十二碳二烯醇+TX、可得蒙+TX、诱蝇酮+TX、环氧十九烷+TX、十二碳-8-烯-1-基乙酸酯+TX、十二碳-9-烯-1-基乙酸酯+TX、十二碳-8+TX、10-二烯-1-基乙酸酯+TX、dominicalure+TX、4-甲基辛酸乙酯+TX、丁香酚+TX、南部松小蠹集合信息素+TX、诱杀烯混剂+TX、诱杀烯混剂I+TX、诱杀烯混剂II+TX、诱杀烯混剂III+TX、诱杀烯混剂IV+TX、己诱剂+TX、齿小蠹二烯醇+TX、小蠹烯醇+TX、金龟子性诱剂+TX、三甲基二氧三环壬烷+TX、lilture+TX、粉纹夜蛾性诱剂+TX、诱杀酯+TX、megatomoic acid+TX、诱虫醚+TX、诱虫烯+TX、十八碳-2,13-二烯-1-基乙酸酯+TX、十八碳-3,13-二烯-1-基乙酸酯+TX、贺康彼+TX、椰蛀犀金龟聚集信息素+TX、非乐康+TX、诱虫环+TX、sordidin+TX、食菌甲诱醇+TX、十四碳-11-烯-1-基乙酸酯+TX、地中海实蝇引诱剂+TX、地中海实蝇引诱剂A+TX、地中海实蝇引诱剂B1+TX、地中海实蝇引诱剂B2+TX、地中海实蝇引诱剂C+TX、trunc-call+TX、2-(辛基硫代)-乙醇+TX、避蚊酮+TX、丁氧基(聚丙二醇)+TX、己二酸二丁酯+TX、邻苯二甲酸二丁酯+TX、丁二酸二丁酯+TX、避蚊胺+TX、驱蚊灵+TX、邻苯二甲酸二甲酯+TX、乙基己二醇+TX、己脲+TX、甲喹丁+TX、甲基新癸酰胺+TX、草氨酸盐+TX、派卡瑞丁+TX、1-二氯-1-硝基乙烷+TX、1,1-二氯-2,2-二(4-乙基苯基)-乙烷+TX、1,2-二氯丙烷与1,3-二氯丙烯+TX、1-溴-2-氯乙烷+TX、2,2,2-三氯-1-(3,4-二氯-苯基)乙基乙酸酯+TX、2,2-二氯乙烯基2-乙基亚磺酰基乙基甲基磷酸酯+TX、2-(1,3-二硫戊环-2-基)苯基二甲基氨基甲酸酯+TX、2-(2-丁氧基乙氧基)乙基硫氰酸酯+TX、2-(4,5-二甲基-1,3-二氧戊环-2-基)苯基甲基氨基甲酸酯+TX、2-(4-氯-3,5-二甲苯基氧基)乙醇+TX、2-氯乙烯基二乙基磷酸酯+TX、2-咪唑啉酮+TX、2-异戊酰茛满-1,3-二酮+TX、2-甲基(丙-2-炔基)氨基苯基甲基氨基甲酸酯+TX、2-氰硫基乙基月桂酸酯+TX、3-溴-1-氯丙-1-烯+TX、3-甲基-1-苯基吡唑-5-基二甲基-氨基甲酸酯+TX、4-甲基

(丙-2-炔基)氨基-3,5-二甲苯基甲基氨基甲酸酯+TX、5,5-二甲基-3-氧代环己-1-烯基二甲基氨基甲酸酯+TX、阿赛硫磷+TX、丙烯腈+TX、艾氏剂+TX、阿洛氮菌素+TX、除害威+TX、 $\alpha$ -蜕化素+TX、磷化铝+TX、灭害威+TX、新烟碱+TX、乙基杀扑磷(athidathion)+TX、甲基吡啶磷+TX、苏云金芽孢杆菌 $\delta$ -内毒素+TX、六氟硅酸钡+TX、多硫化钡+TX、熏菊酯+TX、拜耳22/190+TX、拜耳22408+TX、 $\beta$ -氟氯氰菊酯+TX、 $\beta$ -氯氰菊酯+TX、戊环苄呋菊酯(bioethanomethrin)+TX、生物氯菊酯+TX、双(2-氯乙基)醚+TX、硼砂+TX、溴苯烯磷+TX、溴-DDT+TX、合杀威+TX、畜虫威+TX、特嘧硫磷(butathiofos)+TX、丁酯磷+TX、砷酸钙+TX、氰化钙+TX、二硫化碳+TX、四氯化碳+TX、巴丹盐酸盐+TX、瑟瓦定(cevadine)+TX、冰片丹+TX、氯丹+TX、十氯酮+TX、氯仿+TX、氯化苦+TX、氯胍膦+TX、氯吡唑磷(chlorprazophos)+TX、顺式苄呋菊酯(cis-resmethrin)+TX、顺式苄呋菊酯(cismethrin)+TX、氰菊酯(clocythrins)(别名)+TX、乙酰亚砷酸铜+TX、砷酸铜+TX、油酸铜+TX、畜虫磷(coumithoate)+TX、冰晶石+TX、CS 708+TX、苯腈磷+TX、杀螟腈+TX、环虫菊+TX、赛灭磷+TX、d-胺菊酯+TX、DAEP+TX、棉隆+TX、脱甲基克百威(decarbofuran)+TX、除线特+TX、异氯磷+TX、除线磷+TX、dicresyl+TX、环虫腈+TX、狄氏剂+TX、二乙基5-甲基吡唑-3-基磷酸酯+TX、喘定(dior)+TX、四氟甲醚菊酯+TX、地麦威+TX、苄菊酯+TX、甲基毒虫畏+TX、敌蝇威+TX、丙硝酚+TX、戊硝酚+TX、地乐酚+TX、苯虫醚+TX、蔬果磷+TX、噻喃磷+TX、DSP+TX、脱皮甾酮+TX、EI 1642+TX、EMPC+TX、EPBP+TX、etaphos+TX、乙硫苯威+TX、甲酸乙酯+TX、二溴乙烷+TX、二氯乙烷+TX、环氧乙烷+TX、EXD+TX、皮蝇磷+TX、乙苯威+TX、杀螟硫磷+TX、氧嘧酰胺(fenoxacrim)+TX、吡氯氰菊酯+TX、丰索磷+TX、乙基倍硫磷+TX、氟氯双苯隆(flucufuron)+TX、丁苯硫磷+TX、磷砷酯+TX、丁环硫磷+TX、呋线威+TX、抗虫菊+TX、双胍辛盐+TX、双胍辛乙酸盐+TX、四硫代碳酸钠+TX、苄螬醚+TX、HCH+TX、HEOD+TX、七氯+TX、速杀硫磷+TX、HHDN+TX、氰化氢+TX、喹啉威+TX、IPSP+TX、氯唑磷+TX、碳氯灵+TX、异艾氏剂+TX、异柳磷+TX、移栽灵+TX、稻瘟灵+TX、恶唑磷+TX、保幼激素I+TX、保幼激素II+TX、保幼激素III+TX、氯戊环+TX、烯虫炔酯+TX、砷酸铅+TX、溴苯磷+TX、啉虫磷+TX、噻唑磷+TX、间异丙苯基甲基氨基甲酸酯+TX、磷化镁+TX、叠氮磷+TX、甲基减蚜磷+TX、灭蚜硫磷+TX、氯化亚汞+TX、甲亚砷磷+TX、威百亩+TX、威百亩钾盐+TX、威百亩钠盐+TX、甲基磺酰氟+TX、丁烯胺磷+TX、甲氧普林+TX、甲醚菊酯+TX、甲氧滴滴涕+TX、异硫氰酸甲酯+TX、甲基氯仿+TX、二氯甲烷+TX、恶虫酮+TX、灭蚁灵+TX、奈肽磷+TX、萘+TX、NC-170+TX、烟碱+TX、硫酸烟碱+TX、硝虫噻嗪+TX、原烟碱+TX、0-5-二氯-4-碘代苯基0-乙基乙基硫代膦酸酯+TX、0,0-二乙基0-4-甲基-2-氧代-2H-苯并吡喃-7-基硫代膦酸酯+TX、0,0-二乙基0-6-甲基-2-丙基嘧啶-4-基硫代膦酸酯+TX、0,0,0',0'-四丙基二硫代焦磷酸酯+TX、油酸+TX、对-二氯苯+TX、甲基对硫磷+TX、五氯苯酚+TX、月桂酸五氯苯酯+TX、PH 60-38+TX、芬硫磷+TX、对氯硫磷+TX、磷化氢+TX、甲基辛硫磷+TX、甲胺嘧磷+TX、多氯二环戊二烯异构体+TX、亚砷酸钾+TX、硫氰酸钾+TX、早熟素I+TX、早熟素II+TX、早熟素III+TX、酰胺嘧啶磷+TX、丙氟菊酯+TX、猛杀威+TX、丙硫磷+TX、吡菌磷+TX、反灭虫菊+TX、苦木提取物(quassia)+TX、喹硫磷-甲基+TX、畜宁磷+TX、碘柳胺+TX、苄呋菊脂+TX、鱼藤酮+TX、噻恩菊酯+TX、鱼尼汀+TX、利阿诺定+TX、沙巴藜芦(sabadilla)+TX、八甲磷+TX、克线丹+TX、SI-0009+TX、噻丙腈+TX、亚砷酸钠+TX、氰化钠+TX、氟化钠+TX、六氟硅酸钠+TX、五氯苯酚钠+TX、硒酸钠+TX、硫氰酸钠+TX、磺苯醚隆(sulcofuron)+TX、磺苯醚隆钠盐(sulcofuron-sodium)+TX、硫酰氟+TX、硫丙磷+TX、焦油+TX、噻螨威+TX、TDE+TX、丁基嘧啶磷+TX、双硫磷+TX、环戊烯丙菊酯+TX、四氯乙烷+TX、噻氯

磷+TX、杀虫环+TX、杀虫环草酸盐+TX、虫线磷+TX、杀虫单+TX、杀虫单钠+TX、四溴菊酯+TX、反氯菊酯+TX、唑蚜威+TX、异皮蝇磷-3(trichlormetaphos-3)+TX、毒壤磷+TX、混杀威+TX、三氟甲氧威(tolprocarb)+TX、氯啉菌酯+TX、烯虫硫酯+TX、藜芦定+TX、藜芦碱+TX、XMC+TX、zetamethrin+TX、磷化锌+TX、唑虫磷+TX、氯氟醚菊酯+TX、四氟醚菊酯+TX、双(三丁基锡)氧化物+TX、溴乙酰胺+TX、磷酸铁+TX、氯硝柳胺-乙醇胺+TX、三丁基氧化锡+TX、吡吗啉+TX、蜗螺杀+TX、1,2-二溴-3-氯丙烷+TX、1,3-二氯丙烯+TX、3,4-二氯四氢噻吩1,1-二氧化物+TX、3-(4-氯苯基)-5-甲基罗丹宁+TX、5-甲基-6-硫代-1,3,5-噻二嗪-3-基乙酸+TX、6-异戊烯基氨基嘌呤+TX、anisiflupurin+TX、苯氯噻+TX、细胞分裂素+TX、DCIP+TX、糠醛+TX、异酰胺磷+TX、激动素+TX、疣孢漆斑菌组合物+TX、四氯噻吩+TX、二甲苯酚+TX、玉米素+TX、乙基黄原酸钾+TX、阿拉酸式苯+TX、阿拉酸式苯-S-甲基+TX、大虎杖提取物+TX、 $\alpha$ -氯代醇+TX、安妥+TX、碳酸钡+TX、双鼠脲+TX、溴鼠隆+TX、溴敌隆+TX、溴鼠胺+TX、氯鼠酮+TX、胆钙化醇+TX、氯杀鼠灵+TX、克灭鼠+TX、杀鼠萘+TX、杀鼠嘧啶+TX、鼠得克+TX、噻鼠灵+TX、敌鼠+TX、钙化醇+TX、氟鼠灵+TX、氟乙酰胺+TX、氟鼠啉+TX、氟鼠啉盐酸盐+TX、鼠特灵+TX、毒鼠磷+TX、磷+TX、杀鼠酮+TX、灭鼠优+TX、海葱糖苷+TX、氟乙酸钠+TX、硫酸铊+TX、杀鼠灵+TX、2-(2-丁氧基乙氧基)乙基胡椒酸酯+TX、5-(1,3-苯并二氧杂环戊烯-5-基)-3-己基环己-2-烯酮+TX、具有橙花叔醇的法呢醇+TX、增效炔醚+TX、MGK 264+TX、胡椒基丁醚+TX、增效醛+TX、丙基异构体+TX、S421+TX、增效散+TX、芝麻林素+TX、亚砷+TX、蒽醌+TX、环烷酸铜+TX、王铜+TX、二环戊二烯+TX、塞仑+TX、环烷酸锌+TX、福美锌+TX、衣马宁+TX、利巴韦林+TX、chloroinconazide+TX、氧化汞+TX、甲基托布津+TX、阿扎康唑+TX、联苯三唑醇+TX、糠菌唑+TX、环唑醇+TX、苯醚甲环唑+TX、烯唑醇+TX、氟环唑+TX、腈苯唑+TX、氟啶唑+TX、氟硅唑+TX、粉唑醇+TX、呋吡菌胺+TX、己唑醇+TX、抑霉唑+TX、亚胺唑+TX、种菌唑+TX、叶菌唑+TX、腈菌唑+TX、多效唑+TX、稻瘟酯+TX、戊菌唑+TX、丙硫菌唑+TX、啉斑肟(pyrifenoxy)+TX、咪鲜胺+TX、丙环唑+TX、啉菌唑+TX、硅氟唑(simeconazole)+TX、戊唑醇+TX、氟醚唑+TX、三唑酮+TX、三唑醇+TX、氟菌唑+TX、灭菌唑+TX、嘧啶醇+TX、氯苯嘧啶醇+TX、氟苯嘧啶醇+TX、乙嘧酚磺酸酯(bupirimate)+TX、甲菌定(dimethirimol)+TX、乙菌定(ethirimol)+TX、十二环吗啉+TX、苯锈啉(fenpropidine)+TX、丁苯吗啉+TX、螺环菌胺+TX、十三吗啉+TX、嘧菌环胺+TX、嘧菌胺+TX、嘧霉胺(pyrimethanil)+TX、拌种咯+TX、咯菌腈+TX、苯霜灵(benalaxyl)+TX、呋霜灵(furalaxyl)+TX、甲霜灵+TX、R-甲霜灵+TX、呋酰胺+TX、恶霜灵(oxadixyl)+TX、多菌灵+TX、咪菌威(debacarb)+TX、麦穗宁+TX、噻苯达唑+TX、乙菌利(chlozoline)+TX、菌核利(dichlozoline)+TX、甲菌利(myclozoline)+TX、腐霉利(procymidone)+TX、乙烯菌核利(vinclozoline)+TX、啉酰菌胺(boscalid)+TX、萎锈灵+TX、甲呋酰胺+TX、氟酰胺(flutolanil)+TX、灭锈胺+TX、氧化萎锈灵+TX、吡噻菌胺(penthiopyrad)+TX、噻呋酰胺+TX、多果定+TX、双胍辛胺+TX、嘧菌酯+TX、醚菌胺+TX、烯肟菌酯(enestroburin)+TX、烯肟菌胺+TX、氟菌唑+TX、氟嘧菌酯+TX、醚菌酯+TX、苯氧菌胺+TX、肟菌酯+TX、肟醚菌胺+TX、啉氧菌酯+TX、唑菌胺酯+TX、唑胺菌酯+TX、唑菌酯+TX、福美铁+TX、代森锰锌+TX、代森锰+TX、代森联+TX、甲基代森锌+TX、代森锌+TX、敌菌丹+TX、克菌丹+TX、唑呋草+TX、灭菌丹+TX、对甲抑菌灵+TX、波尔多混合剂+TX、氧化铜+TX、代森锰铜+TX、啉铜+TX、啉菌酯+TX、克瘟散+TX、异稻瘟净+TX、氯瘟磷+TX、甲基立枯磷+TX、敌菌灵+TX、苯噻菌胺+TX、灭瘟素(blasticidin)+TX、地茂散(chloroneb)+TX、百菌清+TX、环氟菌胺+TX、霜脲氰+TX、

cyclobutrifluram+TX、双氯氰菌胺(diclocymet)+TX、吡菌酮(diclomezine)+TX、氯硝胺(dicloran)+TX、乙霉威(diethofencarb)+TX、烯酰吗啉+TX、氟吗啉+TX、二噻农(dithianon)+TX、噻唑菌胺(ethaboxam)+TX、土菌灵(etridiazole)+TX、恶唑菌酮+TX、咪唑菌酮(fenamidone)+TX、稻瘟酰胺(fenoxanil)+TX、噁菌胺(ferimzone)+TX、氟啶胺(fluazinam)+TX、flumetylsulfurim+TX、氟吡菌胺(fluopicolide)+TX、fluoxytioconazole+TX、磺菌胺(flusulfamide)+TX、氟唑菌酰胺+TX、环酰菌胺+TX、三乙膦酸铝(fosetyl-aluminium)+TX、恶霉灵(hymexazol)+TX、丙森锌+TX、赛座灭(cyazofamid)+TX、磺菌威(methasulfocarb)+TX、苯菌酮+TX、戊菌隆(pencycuron)+TX、苯酞+TX、多氧霉素(polyoxins)+TX、霜霉威(propamocarb)+TX、吡菌苯威+TX、碘啶唑酮(proquinazid)+TX、咯啶酮(pyroquilon)+TX、苯啶菌酮(pyriofenone)+TX、啶氧灵+TX、五氯硝基苯+TX、噻唑菌胺+TX、咪唑啉(triazoxide)+TX、三环唑+TX、啉菌灵+TX、有效霉素+TX、缬菌胺+TX、苯酞菌胺(zoxamide)+TX、双炔酰菌胺(mandipropamid)+TX、flubeneteram+TX、吡啶萘菌胺(isopyrazam)+TX、氟唑环菌胺(sedaxane)+TX、苯并烯氟菌唑+TX、氟唑菌酰羟胺+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸(3',4',5'-三氟-联苯-2-基)-酰胺+TX、isoflucypram+TX、异噻菌胺+TX、dipymetitrone+TX、6-乙基-5,7-二氧化-吡咯并[4,5][1,4]二硫杂[1,2-c]异噻唑-3-甲腈+TX、2-(二氟甲基)-N-[3-乙基-1,1-二甲基-茛满-4-基]吡啶-3-甲酰胺+TX、4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基-5-苯基-吡啶-3-甲腈+TX、(R)-3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[1,1,3-三甲基茛满-4-基]吡唑-4-甲酰胺+TX、4-(2-溴-4-氟-苯基)-N-(2-氯-6-氟-苯基)-2,5-二甲基-吡唑-3-胺+TX、4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺+TX、fluindapyr+TX、甲香菌酯(jiaxiangjunzhi)+TX、lvbenmixianan+TX、dichlobentiazox+TX、曼德斯宾(mandestrobin)+TX、3-(4,4-二氟-3,4-二氢-3,3-二甲基异喹啉-1-基)喹诺酮+TX、2-[2-氟-6-[(8-氟-2-甲基-3-喹啉基)氧基]苯基]丙-2-醇+TX、噻啉菌灵(oxathiapirolin)+TX、N-[6-[[[(1-甲基四唑-5-基)-苯基-亚甲基]氨基]氧基甲基]-2-吡啶基]氨基甲酸叔丁酯+TX、pyraziflumid+TX、inpyrfluxam+TX、trolprocarb+TX、氯氟醚菌唑+TX、ipfentrifluconazole+TX、2-(二氟甲基)-N-[(3R)-3-乙基-1,1-二甲基-茛满-4-基]吡啶-3-甲酰胺+TX、N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-[4-(4,5-二氯噻唑-2-基)氧基-2,5-二甲基-苯基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、[2-[3-[2-[1-[2-[3,5-双(二氟甲基)吡唑-1-基]乙酰基]-4-哌啶基]噻唑-4-基]-4,5-二氢异噻唑-5-基]-3-氯-苯基]甲磺酸盐+TX、N-[6-[(Z)-[(1-甲基四唑-5-基)-苯基-亚甲基]氨基]氧基甲基]-2-吡啶基]氨基甲酸丁-3-炔酯+TX、N-[5-[4-(2,4-二甲基苯基)三唑-2-基]-2-甲基-苯基]甲基]氨基甲酸甲酯+TX、3-氯-6-甲基-5-苯基-4-(2,4,6-三氟苯基)吡啶+TX、pyridachlometyl+TX、3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[1,1,3-三甲基茛满-4-基]吡唑-4-甲酰胺+TX、1-[2-[[1-(4-氯苯基)吡唑-3-基]氧基甲基]-3-甲基-苯基]-4-甲基-四唑-5-酮+TX、1-甲基-4-[3-甲基-2-[[2-甲基-4-(3,4,5-三甲基吡唑-1-基)苯氧基]甲基]苯基]四唑-5-酮+TX、氨基pyrifen+TX、唑啉菌胺+TX、吡啶磺菌胺+TX、氟唑菌苯胺+TX、(Z,2E)-5-[1-(4-氯苯基)吡唑-3-基]氧基-2-甲氧基亚氨基-N,3-二甲基-戊-3-烯胺+TX、florylpicoxamid+TX、苯吡克咪德(fenpicoxamid)+TX、迈吡克咪德(metarylpicoxamid)+TX、异丁乙氧喹啉(tebufloquin)+TX、氟苯喹(ipflufenquin)+TX、奎诺福林(quinofumelin)+TX、异丙噻菌胺(isofetamid)+TX、1-[[4-[[2-(三氟甲基)-1,3-二氧戊

环-2-基]甲氧基]苯基]甲基]吡唑-3-甲酸乙酯+TX(可以由W0 2020/056090中描述的方法制备)、1-[[4-[ (Z)-2-乙氧基-3,3,3-三氟-丙-1-烯氧基]苯基]甲基]吡唑-3-甲酸乙酯+TX(可以由W0 2020/056090中描述的方法制备)、N-[[4-[1-(4-环丙基-2,6-二氟-苯基)吡唑-4-基]-2-甲基-苯基]甲基]氨基甲酸甲酯+TX(可以由W0 2020/097012中描述的方法制备)、N-[[4-[1-(2,6-二氟-4-异丙基-苯基)吡唑-4-基]-2-甲基-苯基]甲基]氨基甲酸甲酯+TX(可以由W0 2020/097012中描述的方法制备)、6-氯-3-(3-环丙基-2-氟-苯氧基)-N-[2-(2,4-二甲基苯基)-2,2-二氟-乙基]-5-甲基-哒嗪-4-甲酰胺+TX(可以由W0 2020/109391中描述的方法制备)、6-氯-N-[2-(2-氯-4-甲基-苯基)-2,2-二氟-乙基]-3-(3-环丙基-2-氟-苯氧基)-5-甲基-哒嗪-4-甲酰胺+TX(可以由W0 2020/109391中描述的方法制备)、6-氯-3-(3-环丙基-2-氟-苯氧基)-N-[2-(3,4-二甲基苯基)-2,2-二氟-乙基]-5-甲基-哒嗪-4-甲酰胺+TX(可以由W0 2020/109391中描述的方法制备)、N-[2-[2,4-二氯-苯氧基]苯基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-吡唑-4-甲酰胺+TX、N-[2-[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]苯基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-吡唑-4-甲酰胺+TX、苯噻菌酯+TX、氰烯菌酯+TX、5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇锌盐(2:1)+TX、氟吡菌酰胺+TX、氟虫胺嘧啶(flufenoxadiazam)+TX、氟噻唑菌腈+TX、氟醚菌酰胺+TX、pyrapropoyne+TX、哌碳唑(picarbutrazox)+TX、2-(二氟甲基)-N-(3-乙基-1,1-二甲基-茛满-4-基)吡啶-3-甲酰胺+TX、2-(二氟甲基)-N-((3R)-1,1,3-三甲基茛满-4-基)吡啶-3-甲酰胺+TX、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羟基-3-(1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲腈+TX、metyltetraprole+TX、2-(二氟甲基)-N-((3R)-1,1,3-三甲基茛满-4-基)吡啶-3-甲酰胺+TX、 $\alpha$ -(1,1-二甲基乙基)- $\alpha$ -[4'-(三氟甲氧基)[1,1'-二苯基]-4-基]-5-嘧啶甲醇+TX、fluoxapiprolin+TX、烯肟菌酯(enoxastrobin)+TX、(Z)-3-甲氧基-2-[2-甲基-5-[4-(三氟甲基)三唑-2-基]苯氧基]丙-2-烯酸甲酯+TX、(Z)-3-甲氧基-2-[2-甲基-5-(4-丙基三唑-2-基)苯氧基]丙-2-烯酸甲酯+TX、(Z)-2-[5-(3-异丙基吡唑-1-基)-2-甲基-苯氧基]-3-甲氧基-丙-2-烯酸甲酯+TX、(Z)-3-甲氧基-2-[2-甲基-5-(3-丙基吡唑-1-基)苯氧基]丙-2-烯酸甲酯+TX、(Z)-3-甲氧基-2-[2-甲基-5-[3-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯氧基]丙-2-烯酸甲酯+TX(这些化合物可以由W0 2020/079111中描述的方法制备)、(Z)-2-(5-环己基-2-甲基-苯氧基)-3-甲氧基-丙-2-烯酸甲酯+TX、(Z)-2-(5-环戊基-2-甲基-苯氧基)-3-甲氧基-丙-2-烯酸甲酯+TX(这些化合物可以由W0 2020/193387中描述的方法制备)、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羟基-3-(1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲腈+TX、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羟基-3-(5-硫烷基-1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲腈+TX、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羟基-3-(5-硫代-4H-1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲腈+TX、抗倒酸+TX、丁香菌酯+TX、中生菌素+TX、噻菌铜+TX、噻唑锌+TX、苯唑嘧菌胺(amectotractin)+TX、异菌脲+TX、辛菌胺(seboctylamine)+TX、N'-[5-溴-2-甲基-6-[(1S)-1-甲基-2-丙氧基-乙氧基]-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-[5-溴-2-甲基-6-[(1R)-1-甲基-2-丙氧基-乙氧基]-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-[5-溴-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-[5-氯-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-[5-溴-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-异丙基-N-甲基-甲脒+TX(这些化合物可以由W0 2015/155075中描述的方法制备)、N'-[5-溴-2-甲基-6-(2-丙氧基丙氧基)-

3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX(此种化合物可以由IPCOM000249876D中描述的方法制备);N-异丙基-N'-[5-甲氧基-2-甲基-4-(2,2,2-三氟-1-羟基-1-苯基-乙基)苯基]-N-甲基-甲脒+TX、N'-[4-(1-环丙基-2,2,2-三氟-1-羟基-乙基)-5-甲氧基-2-甲基-苯基]-N-异丙基-N-甲基-甲脒+TX(这些化合物可以由W0 2018/228896中描述的方法制备);N-乙基-N'-[5-甲氧基-2-甲基-4-[(2-三氟甲基)氧杂环丁-2-基]苯基]-N-甲基-甲脒+TX、N-乙基-N'-[5-甲氧基-2-甲基-4-[(2-三氟甲基)四氢呋喃-2-基]苯基]-N-甲基-甲脒+TX(这些化合物可以由W0 2019/110427中描述的方法制备);N-[(1R)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1S)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1R)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1S)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1R)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1S)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、8-氟-N-[(1R)-1-[(3-氟苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]喹啉-3-甲酰胺+TX、8-氟-N-[(1S)-1-[(3-氟苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1R)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1S)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-((1R)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基)-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-((1S)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基)-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX(这些化合物可以由W0 2017/153380中描述的方法制备);1-(6,7-二甲基吡唑并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4,5-三氟-3,3-二甲基-异喹啉+TX、1-(6,7-二甲基吡唑并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4,6-三氟-3,3-二甲基-异喹啉+TX、4,4-二氟-3,3-二甲基-1-(6-甲基吡唑并[1,5-a]吡啶-3-基)异喹啉+TX、4,4-二氟-3,3-二甲基-1-(7-甲基吡唑并[1,5-a]吡啶-3-基)异喹啉+TX、1-(6-氯-7-甲基-吡唑并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-异喹啉+TX(这些化合物可以由W0 2017/025510中描述的方法制备);1-(4,5-二甲基苯并咪唑-1-基)-4,4,5-三氟-3,3-二甲基-异喹啉+TX、1-(4,5-二甲基苯并咪唑-1-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-异喹啉+TX、6-氯-4,4-二氟-3,3-二甲基-1-(4-甲基苯并咪唑-1-基)异喹啉+TX、4,4-二氟-1-(5-氟-4-甲基-苯并咪唑-1-基)-3,3-二甲基-异喹啉+TX、3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-1-异喹啉基)-7,8-二氢-6H-环戊二烯并[e]苯并咪唑+TX(这些化合物可以由W0 2016/156085中描述的方法制备);N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]环丙烷甲酰胺+TX、N,2-二甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙酰胺+TX、N-乙基-2-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙酰胺+TX、1-甲氧基-3-甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脒+TX、1,3-二甲氧基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脒+TX、3-乙基-1-甲氧基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脒+TX、N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙酰胺+TX、4,4-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]异噁唑烷-3-酮+TX、5,5-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]异噁唑烷-3-酮+TX、1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡唑-4-甲酸乙酯+TX、N,N-二甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]-1,2,4-三唑-3-胺+TX。此段落中的化合物可以由W0 2017/055473、W0 2017/055469、W0 2017/093348和W0 2017/118689中描述的方法制备;2-[6-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇+TX(此化合物可以由W0 2017/029179

中描述的方法制备);2-[6-(4-溴苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇+TX(此化合物可以由W0 2017/029179中描述的方法制备);3-[2-(1-氯环丙基)-3-(2-氟苯基)-2-羟基-丙基]咪唑-4-甲腈+TX(此化合物可以由W0 2016/156290中描述的方法制备);3-[2-(1-氯环丙基)-3-(3-氯-2-氟-苯基)-2-羟基-丙基]咪唑-4-甲腈+TX(此化合物可以由W0 2016/156290中描述的方法制备);2-氨基-6-甲基-吡啶-3-甲酸(4-苯氧基苯基)甲酯+TX(此化合物可以由W0 2014/006945中描述的方法制备);2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二噻英并[2,3-c:5,6-c']联吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮+TX(此化合物可以由W0 2011/138281中描述的方法制备);N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]硫代苯甲酰胺+TX;N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺+TX;(Z,2E)-5-[1-(2,4-二氯苯基)吡唑-3-基]氧基-2-甲氧基亚氨基-N,3-二甲基-戊-3-烯酰胺+TX(此化合物可以由W0 2018/153707中描述的方法制备);N'-(2-氯-5-甲基-4-苯氧基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX;N'-[2-氯-4-(2-氟苯氧基)-5-甲基-苯基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX(此化合物可以由W0 2016/202742中描述的方法制备);2-(二氟甲基)-N-[(3S)-3-乙基-1,1-二甲基-茛满-4-基]吡啶-3-甲酰胺+TX(此化合物可以由W0 2014/095675中描述的方法制备);(5-甲基-2-吡啶基)-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲酮+TX、(3-甲基异噁唑-5-基)-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲酮+TX(这些化合物可以由W0 2017/220485中描述的方法制备);2-氧代-N-丙基-2-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙酰胺+TX(此化合物可以由W0 2018/065414中描述的方法制备);1-[[5-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]-2-噻吩基]甲基]吡唑-4-甲酸乙酯+TX(此化合物可以由W0 2018/158365中描述的方法制备);2,2-二氟-N-甲基-2-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙酰胺+TX、N-[(E)-甲氧基亚氨基甲基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺+TX、N-[(Z)-甲氧基亚氨基甲基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺+TX、N-[N-甲氧基-C-甲基-碳酰亚胺基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺+TX(这些化合物可以由W0 2018/202428中描述的方法制备);

[0839] 微生物,其包括:鲁氏不动杆菌(*Acinetobacter lwoffii*)+TX、支顶孢属突起菌(*Acremonium alternatum*)+TX+TX、支顶孢属头孢(*Acremonium cephalosporium*)+TX+TX、支顶孢属柿(*Acremonium diospyri*)+TX、支顶孢属倒棍棒状的(*Acremonium obclavatum*)+TX、棉褐带卷蛾颗粒体病毒(*Adoxophyes orana granulovirus*)(AdoxGV) (**Capex®**)+TX、放射形土壤杆菌(*Agrobacterium radiobacter*)菌株K84(**Galltrol-A®**)+TX、交链格孢菌(*Alternaria alternata*)+TX、链格孢决明子(*Alternaria cassia*)+TX、链格孢属性(*Alternaria destruens*) (**Smolder®**)+TX、白粉寄生孢(*Ampelomyces quisqualis*) (**AQ10®**)+TX、黄曲霉(*Aspergillus flavus*)AF36(**AF36®**)+TX、黄曲霉NRRL 21882 (**Aflaguard®**)+TX、曲霉属物种+TX、出芽短梗霉菌(*Aureobasidium pullulans*)+TX、固氮螺菌属(*Azospirillum*)+TX、(**MicroAZ®**+TX、TAZO **B®**)+TX、固氮菌属(*Azotobacter*)+TX、固氮菌属chroococcum(**Azotomeal®**)+TX、固氮菌属囊肿(*Bionatural Blooming Blossoms®*)+TX、解淀粉芽孢杆菌(*Bacillus amyloliquefaciens*)+TX、蜡样芽孢杆菌(*Bacillus cereus*)+TX、蚀几丁质芽孢杆菌(*Bacillus chitinosporus*)菌株CM-1+TX、芽孢

杆菌属菌株AQ746+TX、地衣芽孢杆菌 (*Bacillus licheniformis*) 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 (*Bacillus circulans*) +TX、坚硬芽孢杆菌 (*Bacillus firmus*) (**BioSafe®**+TX、**BioNem-WP®**+TX、**VOTiVO®**)+TX、坚硬芽孢杆菌菌株I-1582+TX、死海芽孢杆菌 (*Bacillus macerans*) +TX、巨大芽孢杆菌 (*Bacillus marismortui*) +TX、巨大芽孢杆菌 (*Bacillus megaterium*) +TX、蕈状芽孢杆菌 (*Bacillus mycoides*) 菌株AQ726+TX、乳头状瘤芽孢杆菌 (*Bacillus papillae*) (Milky Spore **Powder®**)+TX、短小芽孢杆菌属物种 (*Bacillus pumilus* spp.) +TX、短小芽孢杆菌菌株GB34 (Yield **Shield®**)+TX、短小芽孢杆菌菌株AQ717+TX、短小芽孢杆菌菌株QST 2808 (**Sonata®**+TX、**Ballad Plus®**)+TX、球形芽孢杆菌 (*Bacillus spahericus*) (**VectoLex®**)+TX、芽孢杆菌属物种 (*Bacillus* spp.) +TX、芽孢杆菌菌株AQ175+TX、芽孢杆菌菌株AQ177+TX、芽孢杆菌菌株AQ178+TX、枯草芽孢杆菌属菌株QST 713 (**CEASE®**+TX、**Serenade®**+TX、**Rhapsody®**)+TX、枯草芽孢杆菌属菌株QST714 (**JAZZ®**)+TX、枯草芽孢杆菌属菌株AQ153+TX、枯草芽孢杆菌属菌株AQ743+TX、枯草芽孢杆菌属菌株QST3002+TX、枯草芽孢杆菌属菌株QST3004+TX、枯草芽孢杆菌属变种解淀粉芽孢杆菌菌株FZB24 (**Taegro®**+TX、**Rhizopro®**)+TX、苏云金芽孢杆菌 (*Bacillus thuringiensis*) Cry 2Ae+TX、苏云金芽孢杆菌Cry1Ab+TX、苏云金芽孢杆菌鲎泽亚种 (*Bacillus thuringiensis aizawai*) GC 91 (**Agree®**)+TX、苏云金芽孢杆菌以色列亚种 (*Bacillus thuringiensis israelensis*) (**BMP123®**+TX、**Aquabac®**+TX、**VectoBac®**)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种 (*Bacillus thuringiensis kurstaki*) (**Javelin®**+TX、**Deliver®**+TX、**CryMax®**+TX、**Bonide®**+TX、**Scutella WP®**+TX、**Turilav WP®**+TX、**Astuto®**+TX、**Dipel WP®**+TX、**Biobit®**+TX、**Foray®**)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种 (*Bacillus thuringiensis kurstaki*) BMP 123 (**Baritone®**)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种HD-1 (**Bioprotec-CAF/3P®**)+TX、苏云金芽孢杆菌菌株 (*Bacillus thuringiensis* strain) BD#32+TX、苏云金芽孢杆菌菌株AQ52+TX、苏云金芽孢杆菌鲎泽变种 (*Bacillus thuringiensis* var. *aizawai*) (**XenTari®**+TX、**DiPel®**)+TX、细菌属物种 (**GROWMEND®**+TX、**GROWSWEET®**+TX、**Shootup®**)+TX、密执安棍状杆菌的噬菌体 (bacteriophage of *Clavipacter michiganensis*) (**AgriPhage®**)+TX、**Bakflor®**+TX、球孢白僵菌 (*Beauveria bassiana*) (**Beaugenic®**+TX、**Brocaril WP®**)+TX、球孢白僵菌GHA (Mycotrol **ES®**+TX、Mycotrol **O®**+TX、**BotaniGuard®**)+TX、布氏白僵菌 (*Beauveria brongniartii*) (**Engerlingspilz®**+TX、**Schweizer Beauveria®**+TX、**Melocont®**)+TX、白僵菌属物种 (*Beauveria* spp.) +TX、灰葡萄孢霉 (*Botrytis cineria*) +TX、大豆慢生型根瘤菌 (*Bradyrhizobium japonicum*)

(**TerraMax®**)+TX、短短小芽孢杆菌 (*Brevibacillus brevis*)+TX、苏云金芽孢杆菌拟步行甲 (*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(*Destruxin WP®*)+TX、*Metschnikowia fruticola*(**Shemer®**)+TX、美极梅奇酵母(*Metschnikowia pulcherrima*)+TX、*Microdochium dimerum*(**Antibot®**)+TX、天蓝色小单孢菌(*Micromonospora coerulea*)+TX、*Microsphaeropsis ochracea*+TX、恶臭白色真菌(*Muscodor albus*) 620(**Muscudor®**)+TX、*Muscodor roseus*菌株A3-5+TX、菌根属物种(*Mycorrhizae spp.*) (**AMykor®**+TX、Root **Maximizer®**)+TX、疣孢漆斑菌菌株AARC-0255(**DiTera®**)+TX、BR0S **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 guilhermondii*)+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 (**Sporodex L®**)+TX、纵沟柄锈菌 (*Puccinia canaliculata*)+TX、*Puccinia thlaspeos* (**Wood Warrior®**)+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 (*Rhodospiridium diobovatum*)+TX、圆红冬孢酵母菌 (*Rhodospiridium 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 chlamydosporium)+TX、蜡蚧轮枝菌(Verticillium lecanii)(**Mycotal®**+TX、**Vertalec®**)+TX、Vip3Aa20(**VIPTera®**)+TX、死海枝芽孢杆菌(Virgibacillus marismortui)+TX、野油菜黄单胞菌pv.Poae(**Camperico®**)+TX、伯氏致病杆菌+TX、嗜线虫致病杆菌；

[0840] 植物提取物,其包括: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、荆芥(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

[0841] (**Laminarin®**) ;

[0842] 信息素,其包括: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(3MMEC-GBM Sprayable**Pheromone®**)+TX、卷叶虫信息素(3M MEC-LR Sprayable**Pheromone®**)+TX、家蝇信息素(Muscamone)(Snip7Fly **Bait®**)+TX、Starbar Premium Fly **Bait®**)+TX、梨小食心虫信息素(3M oriental fruit moth sprayable**pheromone®**)+TX、桃透翅蛾(Peachtree Borer)信息素(**Isomate-P®**)+

TX、番茄蛴虫 (Tomato Pinworm) 信息素 (3M Sprayable **pheromone®**) +TX、衣透斯特粉末 (Entostat powder) (来自棕榈树的提取物) (Exosex **CM®**) +TX、(3E,8Z,11Z) -3,8,11-十四碳三烯乙酸酯+TX、(7Z,11Z,13E) -7,11,13-十六三烯醛+TX、(E,Z) -7,9-十二碳二烯-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) +TX;

[0843] 宏生物剂 (Macrobia) ,其包括: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) (**Aphipar®**) +TX、阿尔蚜茧蜂 (**Ervipar®**) +TX、烟蚜茧蜂+TX、桃赤蚜蚜茧蜂 (**Aphipar-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、Coccidoxenoidespermittus (**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、**En-Strip®**)+TX、浆角蚜小蜂(*Eretmocerus 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、*Eretmocerus siphonini*+TX、加州浆角蚜小蜂(*Eretmocerus californicus*)+TX、浆角蚜小蜂(*Eretmocerus eremicus*)(**Ercal®**)+TX、*Eretline e®*)+TX、浆角蚜小蜂(*Eretmocerus eremicus*)(**Bemimix®**)+TX、海氏浆角蚜小蜂+TX、蒙氏浆角蚜小蜂(**Bemipar®**)+TX、*Eretline m®*)+TX、*Eretmocerus 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、*BioNem H®*)+TX、*Exhibitline hm®*)+TX、**Larvanem-M®**)+TX、集栖瓢虫(*Hippodamia convergens*)+TX、尖狭下盾螨(*Hypoaspis aculeifer*)(**Aculeifer-System®**)+TX、**Entomite-A®**)+TX、兵下盾螨(*Hypoaspis miles*)(*Hypoline m®*)+TX、**Entomite-M®**)+TX、黑色枝跗瘿蜂(*Lbalia leucospoides*)+TX、*Lecanoideus floccissimus*+TX、*Lemophagus errabundus*+TX、三色丽突跳小蜂(*Leptomastidea abnormis*)+TX、*Leptomastix dactylopii*(**Leptopar®**)+TX、长角跳小蜂(*Leptomastix epona*)+TX、*Lindorus lophanthae*+TX、*Lipolexis oregmae*+TX、叉叶绿蝇(*Lucilia caesar*)(**Natufly®**)+TX、茶足柄瘤蚜茧蜂(*Lysiphlebus testaceipes*)+TX、暗黑长脊盲蝽(*Macrolophus caliginosus*)(**Mirical-N®**)+TX、*Macroline c®*)+TX、**Mirical®**)+TX、*Mesoseiulus longipes*+TX、黄色阔柄跳小蜂(*Metaphycus flavus*)+TX、*Metaphycus lounsburyi*+TX、角纹脉褐蛉(*Micromus angulatus*)(**Milacewing®**)+TX、黄色花翅跳小蜂(*Microterys flavus*)+TX、*Muscidifurax raptorellus*和*Spalangia*

cameroni (**Biopar®**)+TX、Neodryinus typhlocybae+TX、加州新小绥螨 (Neoseiulus californicus)+TX、瓜钝绥螨 (Neoseiulus cucumeris) (**THRYPEX®**)+TX、虚伪新小绥螨 (Neoseiulus fallacis)+TX、Nesideocoris tenuis (**NesidioBug®**)+TX、**Nesibug®**)+TX、古铜黑蝇 (Ophyra aenescens) (**Biofly®**)+TX、狡小花蝽 (Orius insidiosus) (**Thripor-I®**)+TX、Oriline*i*®)+TX、无毛小花蝽 (Orius laevigatus) (**Thripor-L®**)+TX、Oriline*l*®)+TX、大型小花蝽 (Orius majusculus) (Oriline*m*®)+TX、小黑花椿象 (Orius strigicollis) (**Thripor-S®**)+TX、Pauesia juniperorum+TX、酸酱瓢虫腹柄姬小蜂 (Pediobius foveolatus)+TX、Phasmarhabditis hermaphrodita (**Nemaslug®**)+TX、Phymastichus coffea+TX、Phytoseiulus macropilus+TX、智利小植绥螨 (Phytoseiulus persimilis) (**Spidex®**)+TX、Phytoline*p*®)+TX、斑腹刺益蝽 (Podisus maculiventris) (**Podisus®**)+TX、Pseudacteon curvatus+TX、Pseudacteon obtusus+TX、Pseudacteon tricuspidatus+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) (complex)+TX、胯姬小蜂属 (Quadrastichus spp.)+TX、Rhyzobius lophanthae+TX、澳洲瓢虫 (Rodolia cardinalis)+TX、Rumina decollate+TX、Semielacher petiolatus+TX、麦长管蚜 (Sitobion avenae) (**Ervibank®**)+TX、小卷蛾斯氏线虫 (Steinernema carpocapsae) (Nematac*C*®)+TX、**Millenium®**+TX、BioNem*C*®+TX、**NemAttack®**+TX、**Nemastar®**+TX、**Capsanem®**)+TX、夜蛾斯氏线虫 (**NemaShield®**)+TX、Nemasys **F**®)+TX、BioNem*F*®)+TX、**Steinernema-System®**+TX、**NemAttack®**+TX、**Nemaplus®**+TX、Exhibitline **sf**®)+TX、**Scia-rid®**+TX、**Entonem®**)+TX、锯蜂线虫 (Steinernema kraussei) (Nemasys*L*®)+TX、BioNem*L*®)+TX、Exhibitline*srb*®)+TX、里奥布拉夫线虫 (Steinernema riobrave) (**BioVector®**)+TX、**BioVektor®**)+TX、螯蛄斯氏线虫 (Steinernema scapterisci) (Nematac*S*®)+TX、斯氏线虫属 (Steinernema spp.)+TX、Steinernematid属 (Guardian**Nematodes®**)+TX、深点食螨瓢虫 (Stethorus punctillum) (**Stethorus®**)+TX、亮腹釉小蜂 (Tamarixia radiata)+TX、Tetrastichus setifer+TX、Thripobius semiluteus+TX、中华长尾小蜂 (Torymus sinensis)+TX、甘蓝夜蛾赤眼蜂 (Trichogramma brassicae) (Tricholine*b*®)+TX、甘蓝夜蛾赤眼蜂 (Trichogramma brassicae) (**Tricho-Strip®**)+TX、广赤眼蜂 (Trichogramma evanescens)+TX、微小赤眼蜂 (Trichogramma minutum)+TX、玉米螟赤眼蜂 (Trichogramma ostrinae)+TX、宽脉赤眼蜂 (Trichogramma platneri)+TX、短管赤眼蜂 (Trichogramma pretiosum)+TX、螟黑点瘤姬蜂 (Xanthopimpla stemmator)+TX;

[0844] 其他生物制剂,其包括: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、衍生自特级初榨橄榄油的天然副产物的脂肪酸(**FLIPPER®**) +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(Homobrassonolide) +TX、磷酸铁(Lilly Miller Worry Free Ferramol Slug&Snail **Bait®**) +TX、MCP冰雹捕捉物(hail trap) (Trapline **f®**) +TX、寄生性昆虫南美食甲茧蜂(*Microctonus hyperodae*) +TX、*Mycoleptodiscus terrestris*(**Des-X®**) +TX、**BioGain®** +TX、**Aminomite®** +TX、**Zenox®** +TX、信息素罗网(Thripline**ams®**) +TX、碳酸氢钾(**MilStop®**) +TX、脂肪酸的钾盐(**Sanova®**) +TX、硅酸钾溶液(**Sil-Matrix®**) +TX、碘化钾+硫氰酸钾(**Enzicur®**) +TX、**SuffOil-X®** +TX、蜘蛛毒+TX、蝗虫微孢子虫(*Semaspore Organic Grasshopper Control®*) +TX、粘捕捉物(Trapline **YF®** +TX、Rebell**Amarillo®**) +TX以及捕捉物(Takitrapline **y + b®**) +TX;

[0845] (1) 选自以下的组的抗细菌剂:

[0846] (1.1) 细菌,其实例为摩加夫芽孢杆菌(*Bacillus mojavensis*)菌株R3B(登记号NCAIM(P)B001389) (WO 2013/034938),来自三井物产株式会社(Mitsui&Co.)的子公司瑟缙丝美国公司(Certis USA LLC) +TX;短小芽孢杆菌,特别是菌株BU F-33,具有NRRL登记号50185(可作为**CARTISSA®**产品的部分从巴斯夫公司(BASF)获得,EPA登记号71840-19) +TX;枯草芽孢杆菌,特别是菌株QST713/AQ713(可作为来自美国的拜耳作物科学公司(Bayer CropScience LP)的SERENADE OPTI或SERENADE ASO获得,具有NRRL登记号B21661,美国专利号6,060,051) +TX;枯草芽孢杆菌菌株BU1814,(可作为**VELONDIS®PLUS**、**VELONDIS®FLEX**和**VELONDIS®EXTRA**从巴斯夫公司(BASF SE)获得) +TX;枯草芽孢杆菌变种解淀粉菌株FZB24,具有登记号DSM 10271(可作为**TAEGRO®**或**TAEGRO®ECO**(EPA登记号70127-5)从诺维信公司(Novozymes)获得) +TX;枯草芽孢杆菌CX-9060,来自三井物产株式会社的子公司瑟缙丝美国公司+TX;芽孢杆菌属物种,特别是菌株D747(可作为**DOUBLE NICKEL®**从组合化学工业株式会社(Kumiai Chemical Industry Co.,Ltd.)获得),具有登记号FERM BP-8234,美国专利号7,094,592+TX;类芽孢杆菌属物种菌株,具有登记号NRRL B-50972或登记号NRRL B-67129,WO 2016/154297+TX;多粘类芽孢杆菌,特别是菌株AC-1(例如,来自绿色生物技术有限公司(Green Biotech Company Ltd.)的**TOPSEED®**) +TX;成团泛菌,特别是菌株E325(登记号NRRL B-21856)(可作为BLOOMTIME BIOLOGICAL<sup>TM</sup>FD BIOPESTICIDE从西北农产品公司(Northwest Agri Products)获得) +TX;普罗拉迪克斯假单胞菌(*Pseudomonas proradix*) (例如,来自索控帕德纳公司(Sourcon Padena)的**PRORADIX®**) +TX;以及

[0847] (1.2) 真菌,其实例为出芽短梗霉菌,特别是菌株DSM14940的芽生孢子、菌株DSM

14941的芽生孢子或菌株DSM14940和DSM14941的芽生孢子的混合物(例如,来自瑞士的百奥-菲牧公司(bio-ferm)的**BOTECTOR®**和**BLOSSOM PROTECT®**)+TX;蚜虫拟酵母菌(*Pseudozyma aphidis*)(如耶路撒冷希伯来大学伊森姆研究发展有限公司(Yissum Research Development Company of the Hebrew University of Jerusalem)在WO 2011/151819中所披露的)+TX;酿酒酵母(*Saccharomyces cerevisiae*),特别是菌株CNCM号1-3936、CNCM号1-3937、CNCM号1-3938或CNCM号1-3939(如WO 2010/086790中披露的,来自法国的乐斯福公司(Lesaffre et Compagnie)))+TX;

[0848] (2)选自以下的组的生物杀真菌剂:

[0849] (2.1)细菌,其实例为放射形土壤杆菌菌株K84(例如来自加利福尼亚州的艾格生物化学公司(AgBioChem)的**GALLTROL-A®**)+TX;放射形土壤杆菌菌株K1026(例如来自巴斯夫公司的NOGALL™)+TX;枯草芽孢杆菌变种解淀粉菌株FZB24,具有登记号DSM 10271(可作为**TAEGRO®**或**TAEGRO®**ECO(EPA登记号70127-5)从诺维信公司(Novozymes)获得)+TX;解淀粉芽孢杆菌,特别是菌株D747(可作为Double Nickel™从组合化学工业株式会社获得,具有登记号FERM BP-8234,美国专利号7,094,592)+TX;解淀粉芽孢杆菌菌株F727(也称为菌株MBI110)(NRRL登记号B-50768,WO 2014/028521)(来自马罗尼生物创新公司(Marrone Bio Innovations)的**STARGUS®**)+TX;解淀粉芽孢杆菌菌株FZB42,登记号DSM 23117,(可作为**RHIZOVITAL®**从德国的艾比泰普公司(ABiTEP)获得)+TX;解淀粉芽孢杆菌分离物B246(例如,来自比勒陀利亚大学(University of Pretoria)的AVOGREEN™)+TX;地衣芽孢杆菌,特别是菌株SB3086,具有登记号ATCC 55406,WO 2003/000051(可作为**ECOGUARD®**生物杀真菌剂和GREEN RELEAF™从诺维信公司获得)+TX+TX;地衣芽孢杆菌FMCH001和枯草芽孢杆菌FMCH002(来自FMC公司的**QUARTZO®**(WG)和**PRESENCE®**(WP)))+TX;甲基营养型芽孢杆菌(*Bacillus methylotrophicus*)菌株BAC-9912(来自中国科学院应用生态研究所)+TX;摩加夫芽孢杆菌(*Bacillus mojavensis*)菌株R3B(登记号NCAIM(P) B001389)(WO 2013/034938),来自三井物产株式会社的子公司瑟缇丝美国公司)+TX;蕈状芽孢杆菌分离物,具有登记号B-30890(可作为BMJ**TGAI®**或WG和LifeGard™从三井物产株式会社的子公司瑟缇丝美国公司获得)+TX;短小芽孢杆菌,特别是菌株QST2808(可作为**SONATA®**从美国的拜耳作物科学公司获得,具有登记号NRRL B-30087并且描述于美国专利号6,245,551中)+TX;短小芽孢杆菌,特别是菌株GB34(可作为Yield**Shield®**从德国的拜耳公司(Bayer AG)获得)+TX;短小芽孢杆菌,特别是菌株BU F-33,具有NRRL登记号50185(可作为CARTISSA产品的部分从巴斯夫公司(BASF)获得,EPA登记号71840-19)+TX;枯草芽孢杆菌,特别是菌株QST713/AQ713(可作为SERENADE OPTI或SERENADE ASO从美国的拜耳作物科学公司(Bayer CropScience LP)获得,具有NRRL登记号B21661,并且描述于美国专利号6,060,051中)+TX;枯草芽孢杆菌Y1336(可作为**BIOBAC®**WP从中国台湾的百泰公司(Bion-Tech)获得,作为生物杀真菌剂在中国台湾登记在登记号4764、5454、5096和5277下)+TX;枯草芽孢杆菌菌株MBI 600(可作为SUBTILEX从巴斯夫公司获得,具有登记号NRRL B-50595,美国专利号5,061,495)+TX;枯草芽孢杆菌菌株GB03(可作为**Kodiak®**从德国的拜耳公司获得)+TX;枯草芽孢杆菌菌

株BU1814, (可作为**VELONDIS®** PLUS、**VELONDIS®** FLEX和**VELONDIS®** EXTRA从巴斯夫公司获得)+TX; 枯草芽孢杆菌CX-9060, 来自三井物产株式会社的子公司瑟缇丝美国公司+TX; 枯草芽孢杆菌KTSB菌株(来自唐纳吉公司(Donaghys)的**FOLIACTIVE®**)+TX; 枯草芽孢杆菌IAB/BS03(来自斯托克顿生物-农业技术公司(STK Bio-Ag Technologies)的AVIV™、来自艾戴自然公司(Idai Nature)的**PORTENTO®**)+TX; 枯草芽孢杆菌菌株Y1336(可作为**BIOBAC®** WP从中国台湾的百泰公司获得, 作为生物杀真菌剂在中国台湾登记在登记号4764、5454、5096和5277下)+TX; 附生类芽孢杆菌(*Paenibacillus epiphyticus*) (WO 2016/020371), 来自巴斯夫公司+TX; 多粘类芽孢杆菌植物属物种(WO 2016/020371), 来自巴斯夫公司+TX; 类芽孢杆菌属物种菌株, 具有登记号NRRL B-50972或登记号NRRL B-67129, WO 2016/154297+TX; 绿针假单胞菌菌株AFS009, 具有登记号NRRL B-50897, WO 2017/019448(例如, 来自美国的农业生物群落创新公司(AgBiome Innovations)的HOWLER™和**ZIO®**)+TX; 绿针假单胞菌菌株, 特别是菌株MA342(例如, 由百圭公司(Bioagri)和科伯特(Koppert)公司的**CEDOMON®**、**CERALL®**、和**CEDRESS®**)+TX; 荧光假单胞菌菌株A506(例如, 由新农公司(NuFarm)的**BLIGHTBAN®** A506)+TX; 普罗拉迪克斯假单胞菌(*Pseudomonas proradix*) (例如, 来自索控帕德纳公司的**PRORADIX®**)+TX; 灰绿链霉菌(*Streptomyces griseoviridis*) 菌株K61(也称为鲜黄链霉菌菌株K61)(登记号DSM 7206)(来自瓦德拉公司(Verdera)的**MYCOSTOP®**、来自拜沃公司(BioWorks)的**PREFENCE®**, 参见作物保护2006, 25, 468-475)+TX; 利迪链霉菌(*Streptomyces lydicus*) 菌株WYEC108(也称为利迪链霉菌(*Streptomyces lydicus*) 菌株WYCD108US)(来自诺维信公司的**ACTINO-IRON®**和**ACTINOVATE®**)+TX; 以及

[0850] (2.2) 真菌, 其实例为白粉寄生孢, 特别是菌株AQ 10(例如, 由因特拉化学生物意大利公司(IntrachemBio Italia)的**AQ10®**)+TX; 白粉寄生孢菌株AQ10, 具有登记号CNCM 1-807(例如, 由因特拉化学生物意大利公司的**AQ10®**)+TX; 黄曲霉菌菌株NRRL 21882(作为来自先正达公司(Syngenta)/中国化工公司(ChemChina)的**AFLA-GUARD®**而已知的产品)+TX; 出芽短梗霉菌, 特别是菌株DSM14940的芽生孢子+TX; 出芽短梗霉菌, 特别是菌株DSM 14941的芽生孢子+TX; 出芽短梗霉菌, 特别是菌株DSM14940和DSM 14941的芽生孢子的混合物(例如, 来自瑞士的百奥-菲牧公司的**Botector®**)+TX; 角毛壳菌(*Chaetomium cupreum*) (登记号CABI 353812)(例如, 由农业生活公司(AgriLife)的BIOKUPRUM™)+TX; 球毛壳菌(*Chaetomium globosum*) (可作为**RIVADIOM®**由莱威尔公司(Rivale)获得)+TX; 枝状枝孢菌(*Cladosporium cladosporioides*), 菌株H39, 具有登记号CBS122244, US2010/0291039(由瓦赫宁根研究基金会(Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoek))+TX; 盾壳霉(*Coniothyrium minitans*), 特别是菌株CON/M/91-8(登记号DSM9660, 例如, 来自拜耳作物科学生物公司(Bayer CropScience Biologics GmbH)的**Contans®**)+TX; 微黄隐球菌(*Cryptococcus flavescens*), 菌株3C(NRRL Y-50378), (B2.2.99)+TX; 白秃指状霉(*Dactylaria candida*)+TX; 迪洛弗丝芙拉阿洛配库里

(*Dilophospora alopecuri*) (可作为**TWISTFUNGUS®** 获得)+TX; 尖孢镰刀菌, 菌株 Fo47 (可作为**FUSACLEAN®** 由自然植物保护公司 (Natural Plant Protection) 获得)+TX; 链孢粘帚霉 (*Gliocladium catenulatum*) (同义词: 链状粉红螺旋聚孢霉 (*Clonostachys rosea* f. *catenulate*)) 菌株 J1446 (例如, 由拉曼公司 (Lallemand) 的 **Prestop®**)+TX; 粉红粘帚霉 (*Gliocladium roseum*) (也称为粉红粘帚霉 (*Clonostachys rosea*)), 特别是来自辅加公司 (Adjuvants Plus) 的菌株 321U、如 Xue (Efficacy of *Clonostachys rosea* strain ACM941 and fungicide seed treatments for controlling the root rot complex of field pea [粉红粘帚霉菌株 ACM941 和杀真菌剂种子处理对控制豌豆根腐病复合体的功效], *Can Jour Plant Sci* [加拿大植物学报] 83 (3): 519-524) 中所披露的菌株 ACM941、或菌株 IK726 (Jensen DF 等人 Development of a biocontrol agent for plant disease control with special emphasis on the near commercial fungal antagonist *Clonostachys rosea* strain 'IK726' [特别强调近商业的真菌拮抗剂粉红粘帚霉菌株 'IK726' 的用于植物病害控制的生物控制剂的开发], *Australas Plant Pathol.* [澳大利亚植物病理学] 2007, 36: 95-101)+TX; 蜡蚧轮枝菌 (*Lecanicillium lecanii*) (原称为蜡蚧轮枝菌 (*Verticillium lecanii*)) 菌株 KV01 的分生孢子 (例如, 由科伯特公司/爱利思达公司 (Arysta) 的 **Vertalec®**)+TX; 果生美极梅奇酵母 (*Metschnikowia fructicola*), 特别是菌株 NRRL Y-30752, (B2.2.3)+TX; 赭色小球壳孢菌 (*Microsphaeropsis ochracea*)+TX; 恶臭玫红真菌 (*Muscodor roseus*), 特别是菌株 A3-5 (登记号 NRRL 30548)+TX; 歧皱青霉 (*Penicillium steckii*) (DSM 27859, WO 2015/067800) 来自巴斯夫公司+TX; 蠕形青霉 (*Penicillium vermiculatum*)+TX; 大伏革菌 (*Phlebiopsis gigantea*) 菌株 VRA 1992 (来自丹斯塔发酵公司 (Danstar Ferment) 的 **ROTSTOP®C**)+TX; 异常毕赤酵母, 菌株 WRL-076 (NRRL Y-30842), 美国专利号 7,579,183+TX; 絮状假酵母菌 (*Pseudozyma flocculosa*), 菌株 PF-A22 UL (可作为 **SPORODEX®L** 从加利福尼亚州的植物产品公司 (Plant Products Co.) 获得)+TX; 酿酒酵母 (*Saccharomyces cerevisiae*), 特别是菌株 LAS02 (来自农业酵母及其衍生物公司 (Agro-Levures et Dérivés))、菌株 LAS117 细胞壁 (来自乐斯福公司的 **CEREVISANE®**、来自巴斯夫公司的 **ROMEO®**)、来自法国的乐斯福公司的菌株 CNCM 号 1-3936、CNCM 号 1-3937、CNCM 号 1-3938、CNCM 号 1-3939 (WO 2010/086790)+TX; 新普利利姆拉诺桑尼弗 (*Simplicillium lanosoniveum*)+TX; 黄色篮状菌 (*Talaromyces flavus*), 菌株 V117b+TX; 粗枝木霉 (*Trichoderma asperelloides*) JM41R (登记号 NRRL B-50759) (来自巴斯夫公司的 **TRICHO PLUS®**)+TX; 棘孢木霉 (*Trichoderma asperellum*), 特别是菌株 kd (例如, 来自安德玛特生物控制公司 (Andermatt Biocontrol) 的 T-Gro)+TX; 棘孢木霉 (*Trichoderma asperellum*), 特别是菌株 SKT-1, 具有登记号 FERM P-16510 (例如, 来自组合化学工业株式会社的 **ECO-HOPE®**)、菌株 T34 (例如, 来自西班牙的生物控制技术公司 (Biocontrol Technologies S.L.) 的 T34) 或来自意赛格公司 (Isagro) 的菌株 ICC 012+TX; 深绿木霉 (*Trichoderma atroviride*), 特别是菌株 SC1 (具有登记号 CBS 122089, WO 2009/116106 和美国专利号 8,431,120 (来自农业生物制品公司 (Bi-PA))、菌株 77B (来自安德玛特生物控制

公司的T77)或菌株LU132(例如,来自阿格里牧技术有限公司(Agrimm Technologies Limited)的Sentinel)+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株CNCM 1-1237(例如,来自法国的阿格劳可辛公司(Agrauxine)的**Esquive®**WP)+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株号V08/002387+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株NMI号V08/002388+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株NMI号V08/002389+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株NMI号V08/002390+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株LC52(例如,来自阿格里牧技术有限公司的Tenet)+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株ATCC 20476(IMI206040)+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株T11(IMI352941/CECT20498)+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株SKT-1(FERM P-16510),日本专利公布(小海公司(Kokai))11-253151A+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株SKT-2(FERM P-16511),日本专利公布(小海公司(Kokai))11-253151A+TX;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),菌株SKT-3(FERM P-17021),日本专利公布(小海公司(Kokai))11-253151A+TX;顶孢木霉(*Trichoderma fertile*)(例如,来自巴斯夫公司的产品TrichoPlus)+TX;盖姆斯木霉(*Trichoderma gamsii*)(原绿色木霉),菌株ICC080(IMI CC 392151CABI,例如,由阿格里拜尔索墨西哥公司(AGROBIOSOL DE MEXICO,S.A.DE C.V.)的BioDerma)+TX;盖姆斯木霉(*Trichoderma gamsii*)(原绿色木霉),菌株ICC 080(IMI CC 392151CABI)(可作为**BIODERMA®**从阿格里拜尔索墨西哥公司获得)+TX;钩状木霉(*Trichoderma harmatum*)+TX;钩状木霉(*Trichoderma harmatum*),具有登记号ATCC 28012+TX;哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*)菌株T-22(例如,来自安德玛特生物控制公司或科伯特公司的Trianum-P)或菌株Cepa SimbT5(来自辛伯斯农业公司(Simbiose Agro))+TX;哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*)+TX;哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*)斜面(rifai)T39(例如来自美国的马克特信阿甘公司(Makhteshim)的**Trichodex®**)+TX;哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*),菌株ITEM 908(例如,来自科伯特公司的Trianum-P)+TX;哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*),菌株TH35(例如,来自麦康特尔公司(Mycontrol)的Root-Pro)+TX;哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*),菌株DB 103(可作为**T-GRO®**7456从达古塔特生物实验室(Dagutat Biolab)获得)+TX;多孢木霉(*Trichoderma polysporum*),菌株IMI 206039(例如,由瑞典的BINAB生物创新公司(BINAB Bio-Innovation AB)的Binab TF WP)+TX;子座木霉(*Trichoderma stromaticum*),具有登记号Ts3550(例如,由巴西的可可种植计划执行委员会(CEPLAC)的Tricovab)+TX;绿木霉(*Trichoderma virens*)(也称为绿粘帚霉(*Gliocladium virens*)),特别是菌株GL-21(例如,来自美国的瑟缇丝(Certis)公司的SoilGard)+TX;绿木霉(*Trichoderma virens*)菌株G-41,原称为绿粘帚霉(*Gliocladium virens*)(登记号ATCC 20906)(例如,来自美国的拜沃公司的**ROOTSHIELD®**PLUS WP和**TURFSHIELD®**PLUS WP)+TX;绿色木霉(*Trichoderma viride*),菌株TV1(例如,来自科伯特公司的Trianum-P)+TX;绿色木霉(*Trichoderma viride*),特别是菌株B35(Pietr等人,1993,Zesz.Nauk.A R w Szczecinie[什切青农业大学科学卷]161:125-137)+TX;棘孢木霉(*Trichoderma asperellum*)菌株ICC 012(也称为哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*)ICC012)(具有登记号CABI CC IMI 392716)和盖姆斯木霉(*Trichoderma*

gamsii) (原绿色木霉) 菌株ICC 080 (具有登记号IMI 392151) 的混合物 (例如来自意赛格美国公司的BIO-TAM<sup>TM</sup>和来自阿格里拜尔索墨西哥公司的**BIODERMA®**) +TX; 奥德曼细基格孢 (*Ulocladium oudemansii*) 菌株U3, 具有登记号NM 99/06216 (例如, 来自新西兰的宝特锐曾公司 (Botry-Zen Ltd) 的 **BOTRY-ZEN®** 和来自拜沃公司的 **BOTRYSTOP®**) +TX; 白-黑轮枝菌 (*Verticillium albo-atrum*) (原大丽轮枝菌 (*V. dahliae*)), 菌株WCS850, 具有登记号WCS850, 保藏在真菌培养中心局 (Central Bureau for Fungi Cultures) (例如, 由树木护理创新公司 (Tree Care Innovations) 的DUTCH **TRIG®**) +TX; 厚垣轮枝孢菌 (*Verticillium chlamydosporium*) +TX;

[0851] (3) 选自以下的组的具有改善植物生长和/或植物健康效果的生物控制剂:

[0852] (3.1) 细菌, 其实例为巴西固氮螺菌 (*Azospirillum brasilense*) (例如, 来自可鲁公司 (KALO, Inc.) 的 **VIGOR®**) +TX; 生脂固氮螺菌 (*Azospirillum lipoferum*) (例如, 来自特拉麦克斯公司 (TerraMax, Inc.) 的 VERTEX-IF<sup>TM</sup>) +TX; 茎瘤固氮根瘤菌 (*Azorhizobium caulinodans*), 特别是菌株ZB-SK-5+TX; 圆褐固氮菌 (*Azotobacter chroococcum*), 特别是菌株H23+TX; 棕色固氮菌 (*Azotobacter vinelandii*), 特别是菌株ATCC 12837+TX; 棕色固氮菌 (*Azotobacter vinelandii*) 和巴氏芽孢梭菌 (*Clostridium pasteurianum*) 的混合物 (可作为 **INVIGORATE®** 从阿坤纳斯公司 (Agrinos) 获得) +TX; 解淀粉芽孢杆菌pm414 (来自生物膜作物保护公司 (Biofilm Crop Protection) 的 **LOLI-PEPTA®**) +TX; 解淀粉芽孢杆菌SB3281 (ATCC#PTA-7542, WO 2017/205258) +TX; 解淀粉芽孢杆菌TJ1000 (可作为 **QUIKROOTS®** 从诺维信公司获得) +TX; 解淀粉芽孢杆菌, 特别是菌株IN937a+TX; 解淀粉芽孢杆菌, 特别是菌株FZB42 (例如, 来自德国的艾比泰普公司的 **RHIZOVITAL®**) +TX; 解淀粉芽孢杆菌BS27 (登记号NRRL B-5015) +TX; 蜡样芽孢杆菌科成员EE128 (NRRL号B-50917) +TX; 蜡样芽孢杆菌科成员EE349 (NRRL号B-50928) +TX; 蜡样芽孢杆菌, 特别是菌株BP01 (ATCC 55675, 例如, 来自美国的爱利思达生命科学公司 (Arysta Lifescience) 的 **MEPICHLOR®**) +TX; 坚强芽孢杆菌, 特别是菌株CNMC 1-1582 (例如, 来自巴斯夫公司的 **VOTIVO®**) +TX; 蕈状芽孢杆菌BT155 (NRRL号B-50921) +TX; 蕈状芽孢杆菌EE118 (NRRL号B-50918) +TX; 蕈状芽孢杆菌EE141 (NRRL号B-50916) +TX; 蕈状芽孢杆菌BT46-3 (NRRL号B-50922) +TX; 短小芽孢杆菌, 特别是菌株QST2808 (具有登记号NRRL号B-30087) +TX; 短小芽孢杆菌, 特别是菌株GB34 (例如, 来自德国的拜耳作物科学公司的YIELD **SHIELD®**) +TX; 暹罗芽孢杆菌 (*Bacillus siamensis*), 特别是菌株KCTC 13613T+TX; 枯草芽孢杆菌, 特别是菌株QST713/AQ713 (具有NRRL登记号B-21661并且描述于美国专利号6,060,051中, 可作为 **SERENADE®** OPTI或 **SERENADE®** ASO从美国的拜耳作物科学公司获得) +TX; 枯草芽孢杆菌, 特别是菌株AQ30002 (具有登记号NRRL B-50421并且描述于美国专利申请号13/330,576中) +TX; 枯草芽孢杆菌, 特别是菌株AQ30004 (以及NRRL B-50455并且描述于美国专利申请号13/330,576中) +TX; 枯草芽孢杆菌菌株BU1814 (可作为 **TEQUALIS®** 从巴斯夫公司获得)、枯草芽孢杆菌rm303 (来自生物膜作物保护公司的 **RHIZOMAX®**) +TX; 苏云金芽孢杆菌BT013A (NRRL号B-50924), 也称为苏云金芽孢杆菌4Q7+TX; 地衣芽孢杆菌FMCH001和枯草芽孢杆菌FMCH002的混合物 (可作为

**QUARTZO®** (WG)、**PRESENCE®** (WP) 从FMC公司获得)+TX; 枯草芽孢杆菌, 特别是菌株MBI 600 (例如, 来自巴斯夫公司的**SUBTILEX®**)+TX; 特基拉芽孢杆菌 (*Bacillus tequilensis*), 特别是菌株NII-0943+TX; 大豆慢生型根瘤菌 (*Bradyrhizobium japonicum*) (例如, 来自诺维信公司的**OPTIMIZE®**)+TX; 食酸戴尔福特菌 (*Delftia acidovorans*), 特别是菌株RAY209 (例如, 来自布雷特氧种子公司 (Brett Young Seeds) 的**BIOBOOST®**)+TX; 鹰嘴豆中间根瘤菌 (*Mesorhizobium cicer*) (例如, 来自巴斯夫公司的NODULATOR)+TX; 乳杆菌属物种 (例如, 来自拉特帕菲公司 (LactoPAFI) 的**LACTOPLANT®**)+TX; 豆科根瘤菌 (*Rhizobium leguminosarium* biovar *viciae*) (例如, 来自巴斯夫公司的NODULATOR)+TX; 普罗拉迪克斯假单胞菌 (*Pseudomonas proradix*) (例如, 来自索控帕德纳公司的**PRORADIX®**)+TX; 铜绿假单胞菌, 特别是菌株PN1+TX; 豆科根瘤菌 (*Rhizobium leguminosarum*), 特别是蚕豆根瘤菌 (bv. *viciae*) 菌株Z25 (登记号CECT 4585)+TX; 多粘类芽孢杆菌, 特别是菌株AC-1 (例如, 来自绿色生物技术有限公司的**TOPSEED®**)+TX; 粘质沙雷氏菌 (*Serratia marcescens*), 特别是菌株SRM (登记号MTCC 8708)+TX; 苜蓿中华根瘤菌 (*Sinorhizobium meliloti*) 菌株NRG-185-1 (来自拜耳作物科学公司的**NITRAGIN®** GOLD)+TX; 硫杆菌属物种 (*Thiobacillus* sp.) (例如, 来自英国的克劳普埃德公司 (Cropaid Ltd) 的**CROPAID®**)+TX; 以及

[0853] (3.2) 真菌, 其实例为淡紫字胞菌 (*Purpureocillium lilacinum*) (曾称为淡紫拟青霉 (*Paecilomyces lilacinus*)) 菌株251 (AGAL 89/030550, 例如, 来自拜耳作物科学生物公司的BioAct)+TX; 拜赖青霉 (*Penicillium bilaii*), 菌株ATCC 22348 (例如, 来自阿克塞尔隆生物农业公司 (Acceleron BioAg) 的**JumpStart®**)、黄色篮状菌 (*Talaromyces flavu*), 菌株V117b+TX; 深绿木霉 (*Trichoderma atroviride*) 菌株CNCM 1-1237 (例如, 来自法国的阿格劳可辛公司的**Esquive®** WP)、绿色木霉 (*Trichoderma viride*), 例如菌株B35 (Pietr等人, 1993, Zesz. Nauk. A R w Szczecinie [什切青农业大学科学卷] 161:125-137)+TX; 深绿木霉 (*Trichoderma atroviride*) 菌株LC52 (也称为深绿木霉 (*Trichoderma atroviride*) 菌株LU132, 例如, 来自阿格里牧技术有限公司的Sentinel)+TX; 深绿木霉 (*Trichoderma atroviride*) 菌株SC1 (描述于国际申请号PCT/IT2008/000196中)+TX; 棘孢木霉 (*Trichoderma asperellum*) 菌株kd (例如, 来自安德玛特生物控制公司的T-Gro)+TX; 棘孢木霉 (*Trichoderma asperellum*) 菌株Eco-T (新西兰的植物健康产品公司)、哈茨木霉 (*Trichoderma harzianum*) 菌株T-22 (例如, 来自安德玛特生物控制公司或科伯特公司的Triatum-P)+TX; 疣孢漆斑菌菌株AARC-0255 (例如, 来自华仑生物科学公司 (Valent Biosciences) 的DiTera™)+TX; 拜赖青霉 (*Penicillium bilaii*) 菌株ATCC ATCC20851+TX; 侧雄腐霉菌 (*Pythium oligandrum*) 菌株M1 (ATCC 38472, 例如, 来自捷克的拜奥普雷普罗迪公司 (Bioprepaty) 的Polyversum)+TX; 绿木霉 (*Trichoderma virens*) 菌株GL-21 (例如, 来自美国的瑟缇丝公司的**SoilGard®**)+TX; 白-黑轮枝菌 (*Verticillium albo-atrum*) (原大丽轮枝菌 (*V. dahliae*)) 菌株WCS850 (CBS276.92, 例如, 来自树木护理创新公司的Dutch Trig)+TX; 深绿木霉 (*Trichoderma atroviride*), 特别是菌株号V08/002387、菌株号NMI号V08/002388、菌株号NMI号V08/002389、菌株号NMI号V08/002390+TX; 哈茨木霉

(*Trichoderma harzianum*) 菌株ITEM 908、哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*) 菌株TSTh20+TX;哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*) 菌株1295-22+TX;侧雄腐霉菌(*Pythium oligandrum*) 菌株DV74+TX;阿米尔氏须腹菌(*Rhizopogon amylopogon*) (例如,包含在来自海伦娜化学公司(Helena Chemical Company)的Myco-Sol中)+TX;富尔维氏须腹菌(*Rhizopogon fulvigleba*) (例如,包含在来自海伦娜化学公司的Myco-Sol中)+TX;绿木霉(*Trichoderma virens*) 菌株GI-3+TX;

[0854] (4) 选自以下的杀昆虫活性生物控制剂

[0855] (4.1) 细菌,其实例为放射形杆菌菌株K84(来自艾格生物化学公司的Galltrol)+TX;解淀粉芽孢杆菌,特别是菌株PTS-4838(例如,来自美国的华仑生物科学公司的AVEO)+TX;坚强芽孢杆菌,特别是菌株CNMC 1-1582(例如,来自巴斯夫公司的**VOTIVO®**)+TX;蕈状芽孢杆菌分离物J.(例如,来自三井物产株式会社的子公司瑟缇丝美国公司的BmJ)+TX;球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus*),特别是血清型H5a5b菌株2362(菌株ABTS-1743)(例如,来自美国的华仑生物科学公司的**VECTOLEX®**)+TX;苏云金芽孢杆菌鲇泽亚种(subsp.aizawai),特别是菌株ABTS-1857(SD-1372,例如,来自华仑生物科学公司的**XENTARI®**)+TX;苏云金芽孢杆菌鲇泽亚种(subsp.aizawai),特别是血清型H-7(例如,来自美国的华仑生物科学公司的**FLORBAC®**WG)+TX;苏云金芽孢杆菌以色列(*Bacillus thuringiensis israelensis*) 菌株BMP 144(例如,由伊利诺伊州的贝克尔微生物产品公司(Becker Microbial Products)的**AQUABAC®**)+TX;苏云金芽孢杆菌以色列亚种(subsp.israelensis)(血清型H-14) 菌株AM65-52(登记号ATCC 1276)(例如,由美国的华仑生物科学公司的**VECTOBAC®**)+TX;苏云金芽孢杆菌鲇泽亚种(subsp.aizawai) 菌株GC-91+TX;苏云金芽孢杆菌科尔默变种(var.Colmeri)(例如,由常州市江海化工公司(Changzhou Jianghai Chemical Factory)的TIANBAOBTC)+TX;苏云金芽孢杆菌日本变种菌株Buibui+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(subsp.kurstaki) 菌株BMP 123,来自伊利诺伊州的贝克尔微生物产品公司+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(subsp.kurstaki)由伊利诺伊州的贝克尔微生物产品公司的菌株BMP 123,例如,来自拜耳作物科学公司的BARITONE+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(subsp.kurstaki) 菌株HD-1(例如,来自美国的华仑生物科学公司的**DIPEL®**ES)+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克变种菌株EVB-113-19(例如,来自AEF全球公司(AEF Global)的**BIOPROTEC®**)+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(subsp.kurstaki) 菌株ABTS 351+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(subsp.kurstaki) 菌株PB 54+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(subsp.kurstaki) 菌株SA 11,(来自美国的瑟缇丝公司的JAVELIN)+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(subsp.kurstaki) 菌株SA 12(来自美国的瑟缇丝公司的THURICIDE)+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(subsp.kurstaki) 菌株EG 2348(来自美国的瑟缇丝公司的LEPINOX)+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(subsp.kurstaki) 菌株EG 7841(来自美国的瑟缇丝公司的CRYMAX)+TX;苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种(subsp.tenebrionis) 菌株NB 176(SD-5428,例如,来自德国的拜奥法公司(BioFa)的**NOVODOR®**FC)+TX;侧孢芽孢杆菌(*Brevibacillus laterosporus*) (来自易克利布瑞姆生物公司(Ecolibrium Biologicals)的LATERAL)+TX;伯克霍尔德菌属物种,特别是里诺肯斯伯克霍尔德菌

(*Burkholderia rinojensis*) 菌株A396 (也称为里诺肯斯伯克霍尔德菌 (*Burkholderia rinojensis*) 菌株MBI 305) (登记号NRRL B-50319+TX;WO 2011/106491和WO 2013/032693+TX;例如,来自马罗尼生物创新公司的MBI206TGAI和**ZELTO®**)+TX;铁杉紫色杆菌 (*Chromobacterium subtsugae*),特别是菌株PRAA4-1T (MBI-203+TX;例如,来自马罗尼生物创新公司的**GRANDEVO®**)+TX;蝇蚱芥霉 (*Lecanicillium muscarium*) Ve6 (来自科伯特公司的MYCOTAL)+TX;日本金龟子类芽孢杆菌 (*Paenibacillus popilliae*) (原日本金龟子芽孢杆菌 (*Bacillus popilliae*))+TX;例如来自圣加布里埃尔实验室 (St. Gabriel Laboratories) 的MILKY SPORE POWDER™和MILKY SPORE GRANULAR™)+TX;拟斯扎瓦巴氏杆菌菌株Pn1 (来自先正达公司/中国化工公司的CLARIVA)+TX;嗜虫沙雷氏菌 (*Serratia entomophila*) (例如,由莱特森种子子公司 (Wrightson Seeds) 的**INVADE®**)+TX;粘质沙雷氏菌 (*Serratia marcescens*),特别是菌株SRM (登记号MTCC 8708)+TX;棘孢木霉 (*Trichoderma asperellum*) (来自诺维信公司的TRICHODERMAX)+TX;毕梯斯沃巴契亚体 (*Wolbachia pipientis*) ZAP菌株 (例如,来自莫斯科托梅特公司 (MosquitoMate) 的ZAP**MALES®**)+TX;以及

[0856] (4.2) 真菌,其实例为球孢白僵菌 (*Beauveria bassiana*) 菌株ATCC 74040 (例如,来自因特拉化学生物意大利公司的**NATURALIS®**)+TX;球孢白僵菌 (*Beauveria bassiana*) 菌株GHA (登记号ATCC74250,例如,来自拉弗莱姆国际公司 (Laverlam International Corporation) 的**BOTANIGUARD®**ES和**MYCONTROL-O®**)+TX;球孢白僵菌 (*Beauveria bassiana*) 菌株ATP02 (登记号DSM 24665)+TX;玫烟色棒束孢 (*Isaria fumosorosea*) (曾称为玫烟色拟青霉) 菌株Apopka 97,来自赛普洛公司 (SePRO) 的PREFERAL+TX;绿僵菌3213-1 (保藏在NRRL登记号67074下) (WO 2017/066094+TX;先锋良种国际公司 (Pioneer Hi-Bred International))+TX;罗伯茨绿僵菌 (*Metarhizium robertsii*) 15013-1 (保藏在NRRL登记号67073下)+TX;罗伯茨绿僵菌 (*Metarhizium robertsii*) 23013-3 (保藏在NRRL登记号67075下)+TX;淡紫色拟青霉菌株251 (来自美国的瑟缇丝公司的MELOCON)+TX;拉迪肯虫瘟霉 (*Zoophtora radicans*)+TX;

[0857] (5) 选自由以下组成的组的病毒:棉褐带卷蛾 (苹果小卷蛾 (summer fruit tortrix)) 颗粒体病毒 (GV)+TX;苹果蠹蛾 (*Cydia pomonella*/codling moth) 颗粒体病毒 (GV)+TX;棉铃虫 (*Helicoverpa armigera*/cotton bollworm) 核型多角体病毒 (NPV)+TX;甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua*/beet armyworm) mNPV+TX;草地贪夜蛾 (秋夜蛾) mNPV+TX;海灰翅夜蛾 (非洲棉叶蛾) NPV+TX;

[0858] (6) 可以被作为“接种剂”添加至植物或植物部分或植物器官、并且由于其特定特性而促进植物生长和植物健康的选自以下的细菌和真菌:土壤杆菌属物种 (*Agrobacterium* spp.)+TX;茎瘤固氮根瘤菌 (*Azorhizobium caulinodans*)+TX;固氮螺菌属物种+TX;固氮菌属物种+TX;慢生型根瘤菌属物种+TX;伯克霍尔德菌属物种 (*Burkholderia* spp.),特别是洋葱伯克霍尔德菌 (*Burkholderia cepacia*) (原称为洋葱假单胞菌)+TX;巨孢囊霉属物种或单孢巨孢囊霉 (*Gigaspora monosporum*)+TX;球囊霉属物种 (*Glomus* spp.)+TX;蜡蘑属物种 (*Laccaria* spp.)+TX;布氏乳杆菌 (*LactoBacillus buchneri*)+TX;类球囊霉属 (*Paraglomus* spp.)+TX;采色豆马勃 (*Pisolithus tinctorus*)+TX;假单胞菌属物种+TX;根

瘤菌属物种,特别是三叶草根瘤菌(*Rhizobium trifolii*)+TX;须腹菌属物种(*Rhizopogon* spp.)+TX;硬皮马勃属物种(*Scleroderma* spp.)+TX;乳牛肝菌属物种(*Suillus* spp.) +TX;链霉菌属物种+TX;

[0859] (7)可用作生物控制剂的植物提取物和由微生物形成的产物(包括蛋白质和次生代谢物),其选自大蒜(*Allium sativum*) (来自艾科斯普瑞公司(Eco-Spray)的NEMGUARD+TX;来自安道麦公司(ADAMA)的BRALIC)+TX;Armour-Zen+TX;苦艾(*Artemisia absinthium*) +TX;印楝素(例如,来自美国的瑟缇丝公司的AZATIN XL)+TX;Biokeeper WP+TX;十字花科(Brassicaceae)提取物,特别是油菜粉或芥菜粉+TX;黑决明子(*Cassia nigricans*)+TX;苦皮藤(*Celastrus angulatus*)+TX;美洲土荆芥(*Chenopodium anthelminticum*)+TX;几丁质(Chitin)+TX;欧洲鳞毛蕨(*Dryopteris filix-mas*)+TX;问荆(*Equisetum arvense*)+TX; Fortune Aza+TX;Fungastop+TX;Heads Up(藜麦皂苷(*Chenopodium quinoa saponin*)提取物)+TX;PROBLAD(来自羽扇豆种子的天然Blad多肽),瑟缇丝欧洲公司+TX;FRACTURE(来自羽扇豆种子的天然Blad多肽),FMC公司+TX;除虫菊(*Pyrethrum*)/除虫菊酯(Pyrethrins)+TX;苏里南苦木(*Quassia amara*)+TX;栎(*Quercus*)+TX;皂树(*Quillaja*)提取物(来自巴斯夫公司的QL AGRI 35)+TX;大虎杖提取物(来自马罗尼生物公司(Marrone Bio)的REGALLIA/REGALIA MAXX)+TX;“Requiem<sup>TM</sup>杀昆虫剂”+TX;鱼藤酮+TX;鱼尼丁(ryania)/兰尼碱(ryanodine)+TX;聚合草(*Symphytum officinale*)+TX;菊蒿+TX;百里酚(Thymol)+TX;与香叶醇(Geraniol)混合的百里酚(Thymol) (来自伊甸研究公司(Eden Research)的CEDROZ)+TX;与香叶醇(Geraniol)和丁子香酚(Eugenol)混合的百里酚(Thymol) (来自伊甸研究公司的MEVALONE)+TX;Triact 70+TX;TriCon+TX;旱金莲(*Tropaeolum majus*)+TX;互叶白千层提取物(*Melaleuca alternifolia*) (来自斯托克顿公司(STK)的TIMOREX GOLD)+TX;大荨麻(*Urtica dioica*)+TX;藜芦碱(Veratrin)+TX;和白槲寄生(*Viscum album*)+TX;以及

[0860] 安全剂,如解草啉+TX、解草酯(包括解草酯-甲基)+TX、环丙磺酰胺+TX、二氯丙烯胺+TX、解草唑(包括解草唑-乙基)+TX、解草啉+TX、氟草肟+TX、解草噁唑+TX、双苯噁唑酸(包括双苯噁唑酸-乙基)+TX、吡唑解草酯(mefenpyr) (包括吡唑解草酯-二乙基)+TX、麦卡米芬(metcamifen)+TX和解草腈+TX。

[0861] 在活性成分之后的括号中的参考,例如[3878-19-1]是指化学文摘登记号。上文描述的混合配伍物是已知的。在活性成分包括在“The Pesticide Manual[杀有害生物剂手册]”[The Pesticide Manual-AWorld 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 Council[英国农作物保护委员会]]中的情况下,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“阿维菌素”以条目编号(1)来描述。其中“[CCN]”是上文对于特定化合物来加上的,该考虑中的化合物包括在“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“乙酰虫脒”描述于互联网地址<http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>中。

[0862] 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。

[0863] 选自表A-1至A-78、B-1至B-78、C-1至C-21和D-1至D-21中所定义的化合物的具有式(I)的化合物与以上所述的活性成分的活性成分混合物包含选自表A-1至A-78、B-1至B-78、C-1至C-21和D-1至D-21中所定义的一种化合物的化合物和如上所述的活性成分,其优选地处于从100:1至1:6000、尤其是从50:1至1:50的混合比率,更尤其是处于从20:1至1:20、甚至更尤其是从10:1至1:10、非常尤其是从5:1至1:5的比率,特别优选的是从2:1至1:2的比率,并且从4:1至2:1的比率同样是优选的,尤其是处于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。

[0864] 如上所述的化合物和混合物可以被用于控制有害生物的方法中,该方法包括将分别含如上文所述的化合物或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。

[0865] 包含选自表A-1至A-78、B-1至B-78、C-1至C-21和D-1至D-21中所定义的化合物的具有式(I)的化合物以及一种或多种如以上描述的活性成分的混合物可以例如以单一的“掺水即用”的形式施用,以组合的喷洒混合物(该混合物由这些单一活性成分的单独配制品构成)(如“桶混制剂”)施用,并且当以顺序方式(即,一个在另一个适度短的时期之后,例如几小时或几天)施用时组合使用这些单一活性成分来施用。施用具有式(I)的化合物与如上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。

[0866] 根据本发明的组合物还可以包含其他固体或液体助剂,如稳定剂,例如未环氧化的或环氧化的植物油(例如环氧化的椰子油、菜籽油或大豆油),消泡剂(例如硅油),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。

[0867] 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以及化合物I用于制备这些组合物的用途也是本发明的主题。

[0868] 这些组合物的施用方法,即控制上述类型的有害生物的方法,如喷雾、雾化、撒粉、刷涂、包衣、撒播或浇灌-它们被选择以适于普遍情况的预期目的-以及这些组合物用于控制上述类型的有害生物的用途是本发明的其他主题。典型的浓度比是在0.1与1000ppm之间、优选在0.1与500ppm之间的活性成分。每公顷的施用比率总体上是每公顷1至2000g活性成分、特别是10至1000g/ha、优选地是10至600g/ha。

[0869] 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(叶面施用),可能的是选择施用的频率和比率以符合所讨论的有害生物的侵染风险。可替代地,该活性成分可以通过根系统(内吸作用)到达植物,其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中(例如引入土壤中,例如以颗粒剂的形式(土施))。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。

[0870] 本发明的具有式(I)的化合物及其组合物还适合于植物繁殖材料(例如种子,如果实、块茎或籽粒,或者苗圃植物)的保护,以对抗上述类型的有害生物。可以用该化合物在种植前对该繁殖材料进行处理,例如可以在播种前对种子进行处理。可替代地,可以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将该化合物施用至种子籽粒(包衣)。还可能在将该繁殖材料种植在施用场地时施用这些组合物,例如在条播期间将这些组合物施入种子犁沟。这些用于植物繁殖材料的处理方法和如此处理的植物繁殖材料是本发明另外的主题。典型的处理比率将取决于有待控制的植物以及有害生物/真菌,并且通常在每100kg种子1克至200克之间、优选在每100kg种子5克至150克之间,如在每100kg种子10克至100克之间。

[0871] 术语种子包括所有种类的种子以及植物繁殖体,包括但不限于真正的种子、种子块、吸盘、谷粒、鳞球茎、果实、块茎、谷物、根茎、插条、切割枝条等并且在优选实施例中意指真正的种子。

[0872] 本发明还包括用具有式(I)的化合物包衣或处理的种子或含有具有式(I)的化合物的种子。尽管取决于施用的方法成分的更多或更少的部分可以渗透到所述种子材料中,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(再)种植所述种子产品时,它可以吸收活性成分。在实施例中,本发明使得可获得其上粘附有具有式(I)的化合物的植物繁殖材料。此外,由此使得可获得包含用具有式(I)的化合物处理过的植物繁殖材料的组合物。

[0873] 种子处理包括本领域中已知的所有合适的种子处理技术,如拌种、种子包衣、种子撒粉、浸种以及种子造粒。可以通过任何已知的方法进行具有式(I)的化合物的种子处理施用,如在种子播种之前或播种/种植过程中对种子喷雾或撒粉。

[0874] 本发明的化合物可以凭借在低施用比率下的更大功效和/或不同有害生物控制而区别于其他类似化合物,这可以由本领域技术人员使用实验程序,使用较低的浓度(如果需要),例如10ppm、5ppm、2ppm、1ppm或0.2ppm;或较低施用比率,如每m<sup>2</sup> 300、200或100mg AI来验证。通过增加的安全性(对地上和地下非靶标生物体(如鱼、鸟和蜜蜂)、改进的物理-化学特性或增加的生物可降解性)可以观察到更大的效力。

[0875] 在本发明的每个方面以及实施例中,“主要由……组成的”以及其变化(inflections)是“包含”以及其变化的优选实施例,并且“由……组成的”以及其变化是“主要由……组成”以及其变化的优选实施例。

[0876] 本申请的披露内容使得可获得在本文中披露的实施例的每种组合。

[0877] 应当指出的是,本文中关于具有式(I)的化合物的披露内容关于具有式(I\*)、(I-A)、(I-B)、(I-C)和(I-D)中每一种的化合物以及表A-1至A-78、B-1至B-78、C-1至C-21以及D-1至D-21的化合物同样适用。

[0878] 实例

[0879] 配制品实例

[0880] 以下实例进一步说明了(但不限制)本发明。

| <u>可湿性粉剂</u> |                         | a)  | b)  | c)  |
|--------------|-------------------------|-----|-----|-----|
| [0881]       | 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 (7-8 mol 的环氧乙烷) | -   | 2%  | -   |
|              | 高度分散的硅酸                 | 5%  | 10% | 10% |
|              | 高岭土                     | 62% | 27% | -   |

[0882] 将该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。

| <u>干种子处理用的粉剂</u> |         | a)  | b)  | c)  |
|------------------|---------|-----|-----|-----|
| [0883]           | 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% |

[0884] 将该组合与辅助剂充分混合并且将该混合物在适合的研磨机中充分研磨,从而获得可以直接用于种子处理的粉剂。

[0885] 可乳化浓缩物

|        |                          |     |
|--------|--------------------------|-----|
| [0886] | 活性成分                     | 10% |
|        | 辛基酚聚乙二醇醚 (4-5 mol 的环氧乙烷) | 3%  |
|        | 十二烷基苯磺酸钙                 | 3%  |
|        | 蓖麻油聚乙二醇醚 (35 mol 环氧乙烷)   | 4%  |
|        | 环己酮                      | 30% |
|        | 二甲苯混合物                   | 50% |

[0887] 在植物保护中可以使用的具有任何所要求的稀释度的乳液可以通过用水稀释从该浓缩物获得。

| <u>尘粉剂</u>                                                                                                               |                        | a)  | b)  | c)  |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------|-----|-----|-----|
|                                                                                                                          | 活性成分                   | 5%  | 6%  | 4%  |
| [0888]                                                                                                                   | 滑石                     | 95% | -   | -   |
|                                                                                                                          | 高岭土                    | -   | 94% | -   |
|                                                                                                                          | 矿物填充剂                  | -   | -   | 96% |
| [0889] 通过将该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粉剂。此类粉剂还可以用于种子的干拌种。                                                             |                        |     |     |     |
| [0890]                                                                                                                   | <u>挤出机颗粒</u>           |     |     |     |
|                                                                                                                          | 活性成分                   | 15% |     |     |
| [0891]                                                                                                                   | 木质素磺酸钠                 | 2%  |     |     |
|                                                                                                                          | 羧甲基纤维素                 | 1%  |     |     |
| [0892]                                                                                                                   | 高岭土                    | 82% |     |     |
| [0893] 将该组合与这些辅助剂混合并且研磨,并且将混合物用水湿润。将混合物挤出并且然后在空气流中干燥。                                                                    |                        |     |     |     |
| [0894]                                                                                                                   | <u>包衣的颗粒</u>           |     |     |     |
| [0895]                                                                                                                   | 活性成分                   | 8%  |     |     |
| [0896]                                                                                                                   | 聚乙二醇(分子量200)           | 3%  |     |     |
| [0897]                                                                                                                   | 高岭土                    | 89% |     |     |
| [0898] 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。                                                                 |                        |     |     |     |
| [0899]                                                                                                                   | <u>悬浮剂浓缩物</u>          |     |     |     |
|                                                                                                                          | 活性成分                   | 40% |     |     |
|                                                                                                                          | 丙二醇                    | 10% |     |     |
|                                                                                                                          | 壬基酚聚乙二醇醚(15 mol 的环氧乙烷) | 6%  |     |     |
| [0900]                                                                                                                   | 木质素磺酸钠                 | 10% |     |     |
|                                                                                                                          | 羧甲基纤维素                 | 1%  |     |     |
|                                                                                                                          | 硅油(处于在水中 75%的乳液的形式)    | 1%  |     |     |
|                                                                                                                          | 水                      | 32% |     |     |
| [0901] 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,从该悬浮液浓缩物可以通过用水稀释获得具有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通过喷洒、倾倒或浸渍保护其对抗微生物的侵染。 |                        |     |     |     |
| [0902]                                                                                                                   | <u>种子处理用的可流动性浓缩物</u>   |     |     |     |

|        |                                        |              |
|--------|----------------------------------------|--------------|
|        | <b>活性成分</b>                            | <b>40%</b>   |
|        | <b>丙二醇</b>                             | <b>5%</b>    |
|        | <b>共聚物丁醇 PO/EO</b>                     | <b>2%</b>    |
| [0903] | <b>三苯乙烯酚, 具有 10-20 摩尔 EO</b>           | <b>2%</b>    |
|        | <b>1,2-苯并异噻唑啉-3-酮 (处于在水中 20%的溶液形式)</b> | <b>0.5%</b>  |
|        | <b>单偶氮-颜料钙盐</b>                        | <b>5%</b>    |
| [0904] | <b>硅油 (处于在水中 75%的乳液的形式)</b>            | <b>0.2%</b>  |
|        | <b>水</b>                               | <b>45.3%</b> |

[0905] 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,从该悬浮液浓缩物可以通过用水稀释获得具有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通过喷洒、倾倒或浸渍保护其对抗微生物的侵染。

#### [0906] 缓释的胶囊悬浮液

[0907] 将28份的组合与2份的芳香族溶剂以及7份的甲苯二异氰酸酯/多亚甲基-聚苯基异氰酸酯-混合物(8:1)进行混合。将此混合物在1.2份的聚乙烯醇、0.05份的消泡剂以及51.6份的水的混合物中进行乳化直至达到所希望的粒度。向此乳液中添加在5.3份的水中的2.8份的1,6-己二胺混合物。将混合物搅拌直至聚合反应完成。将获得的胶囊悬浮液通过添加0.25份的增稠剂以及3份的分散剂进行稳定。该胶囊悬浮液配制品包含28%的活性成分。该介质胶囊的直径是8微米-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。

#### [0908] 制备实例

[0909] 以下制备实例进一步说明(但不限制)本发明。本领域技术人员将从这些程序中迅速地认识到有关反应物以及有关反应条件和技术适当变体。贯穿本说明书,以摄氏度(°C)给出温度。“Mp”意指以°C计的熔点。除非另外指出,否则<sup>1</sup>H NMR光谱是在400MHz下记录的并且<sup>19</sup>F NMR光谱是在377MHz下记录的。化学位移以ppm记录。使用了以下缩写:s=单峰;br s=宽峰;d=二重峰;br d=宽二重峰;dd=双二重峰;dt=双三重峰;t=三重峰,tt=三三重峰,q=四重峰,quin=五重峰,sept=七重峰;m=多重峰。用以下LCMS方法中的任一种来表征这些化合物。对于每种化合物获得的特征LCMS值是保留时间(“Rt”,以分钟记录)和测得的分子离子(M+H)<sup>+</sup>或(M-H)<sup>-</sup>。

#### [0910] LCMS方法:

##### [0911] 方法1:

[0912] 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,该质谱仪配备有电喷射源(极性:正离子或负离子,MS2扫描,毛细管:7.00kV,碎裂器:120V,去溶剂化温度:350°C,气体流量:11L/min,雾化器气体:40psi,质量范围:110至650Da)和来自安捷伦公司的1200系列HPLC:四元泵,经加热的柱室以及二极管阵列检测器。柱:KINETEX EVO C18,2.6μm,50×4.6mm,温度:40°C,DAD波长(nm):254,溶剂

梯度:A=水+5%乙腈+0.1% HCOOH,B=乙腈+0.1% HCOOH;梯度:0min 10% B,90%A;0.9-1.8min 100% B;1.8-2.2min100%-10% B;2.2-2.5min 10%B;流量 (mL/min)1.8。

[0913] 方法2:

[0914] 在来自沃特斯公司(Waters)的质谱仪(SQD、SQDII单四极杆质谱仪)上记录光谱,该质谱仪配备有电喷射源(极性:正离子和负离子,毛细管:3.00kV,锥孔范围:41V,萃取器:2.00V,源温度:150℃,去溶剂化温度:5000℃,锥孔气体流量:50l/h,去溶剂化气体流量:1000l/h;质量范围:110至800Da)以及来自沃特斯公司的Acquity UPLC:二元泵、经加热的柱室、二极管阵列检测器和ELSD检测器。柱:Waters UPLC HSS T3 C18,1.8μm,30×2.1mm,温度:40℃,PDA波长范围(nm):200至400,溶剂梯度:A=水+5%乙腈+0.1% HCOOH,B=乙腈+0.05% HCOOH;梯度:10%-100% B,在1.3min内;流量 (ml/min)0.6。

[0915] 方法3:

[0916] 在来自沃特斯公司的质谱仪(SQD、SQDII或QDA单四极杆质谱仪)上记录光谱,该质谱仪配备有电喷射源(极性:正离子和负离子,毛细管:0.8-3.00kV,锥孔:5-30V,源温度:120℃-150℃,去溶剂化温度:350℃-600℃,锥孔气体流量:50-150l/h,去溶剂化气体流量:650-1000l/h;质量范围:50至900Da)以及来自沃特斯公司的Acquity UPLC:二元泵、经加热的柱室、二极管阵列检测器以及ELSD。柱:Waters UPLC HSS T3,1.8μm,30×2.1mm,温度:60℃,DAD波长范围(nm):210至400,运行时间:1.5min;溶剂:A=水+5% MeOH+0.05% HCOOH,B=乙腈+0.05% HCOOH;流量 (ml/min)0.85,梯度:10% B等度持续0.2min,然后在1.0min内10%-100% B,100% B等度持续0.2min,在0.05min内100%-10%B,10% B等度持续0.05min。

[0917] 方法4:

[0918] 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,该质谱仪配备有电喷射源(极性:正离子或负离子,MS2扫描,毛细管:4.00kV,碎裂器:100V,去溶剂化温度:350℃,气体流量:11L/min,雾化器气体:45psi,质量范围:110至1000Da)和来自安捷伦公司的1200系列HPLC:四元泵,经加热的柱室以及VWD检测器。柱:KINETEX EVO C18,2.6μm,50×4.6mm,温度:40℃,检测器VWD波长:254nm,溶剂梯度:A=水+5%乙腈+0.1% HCOOH,B=乙腈+0.1% HCOOH;梯度:0min 10% B,90%A;0.9-1.8min 100% B;1.8-2.2min 100%-10% B;2.2-2.5min 10%B;流量 (mL/min)1.8。

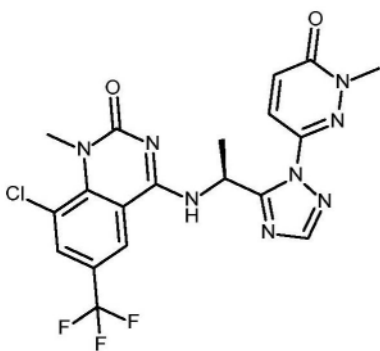
[0919] 方法5:

[0920] SFC:Waters Acquity UPC<sup>2</sup>/QDa;PDA检测器Waters Acquity UPC2;柱:Daicel SFC**CHIRALPAK**<sup>®</sup>OZ,3μm,0.46cm×10cm,40℃;流动相:A:CO<sub>2</sub> B:MeOH等度:在4.8min中20% B;ABPR:1800psi;流速:2.0ml/min;检测:290nm;样品浓度:在ACN中1mg/mL;注射:2μL。

[0921] QDa:[MS<sup>+</sup>]:来自沃特斯公司的质谱仪(QDa)(极性:正离子和负离子),检测器增益1,样品温度:500℃,锥孔电压:10V,ESI毛细管正电压0.8-负电压0.8,取样频率5Hz,质量范围:100至850Da。

[0922] 实例P1:8-氯-1-甲基-4-[[ (1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基]-6-(三氟甲基)喹唑啉-2-酮(化合物P1)的制备

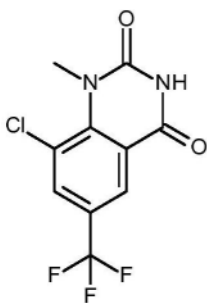
[0923]



(P1)

[0924] 步骤A: 8-氯-1-甲基-6-(三氟甲基)喹唑啉-2,4-二酮(I-1)的制备

[0925]



(I-1)

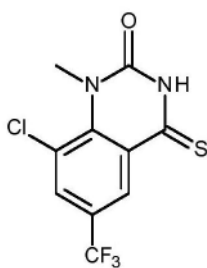
[0926] 在室温下向3-氯-2-(甲基氨基)-5-(三氟甲基)苄腈(CAS 2673195-89-4) (4.26mmol, 1g)在二氯甲烷(10mL)中的混合物中添加N-(氧代亚甲基)氨基磺酰氯(0.904, 6.39mmol)。将反应物在室温下搅拌24h。通过薄层色谱法(TLC)监测反应并确认转化。在旋转蒸发仪(rotavapor)上蒸发溶剂并将残余物在150ml 2N HCl水溶液在100℃下加热6h。将所得固体过滤并且干燥以提供呈白色固体的8-氯-4-羟基-1-甲基-6-(三氟甲基)喹唑啉-2-酮(1.1g, 83%)。

[0927]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$ : 12.03(s, 1H), 8.22(d, 1H), 8.16(d, 1H), 3.65(m, 3H)。

[0928] LCMS(方法2): 保留时间1.06min,  $m/z$  276.9[M-H] $^-$ 。

[0929] 步骤B: 8-氯-1-甲基-4-硫代-6-(三氟甲基)喹唑啉-2-酮(I-2)的制备

[0930]



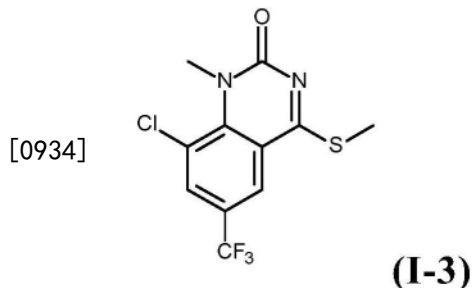
(I-2)

[0931] 在25ml圆底烧瓶(RBF)中,将8-氯-1-甲基-6-(三氟甲基)喹唑啉-2,4-二酮(I-1) (0.2g, 0.717mmol)添加到甲苯(4mL)中。然后在室温下添加劳森(Lawesson)试剂(2,4-双(4-甲氧基苯基)-2,4-二硫代-1,3,2 $\lambda^5$ ,4 $\lambda^5$ -二硫杂二磷杂环丁烷) (0.299g, 0.717mmol)。将反应混合物在90℃下加热20h。通过LCMS监测反应并确认转化。将反应物用2N NaOH淬灭并用EtOAc(50ml $\times$ 2)萃取。有机层用盐水洗涤,经Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>干燥并浓缩。将粗品吸附在硅胶上并使用硅胶柱通过combi flash纯化,并用EtOAc在环己烷中的梯度体系洗脱,并且浓缩所需级分以获得呈黄色固体的8-氯-1-甲基-4-硫代-6-(三氟甲基)喹唑啉-2-酮(0.25g, 60质

量%, 70.913%)。取出产物不经进一步纯化地原样用于下一反应。

[0932] LCMS(方法2):保留时间1.13min,  $m/z$  293.0  $[M-H]^-$ 。

[0933] 步骤C: 8-氯-1-甲基-4-硫代-6-(三氟甲基)喹唑啉-2-酮(I-3)的制备

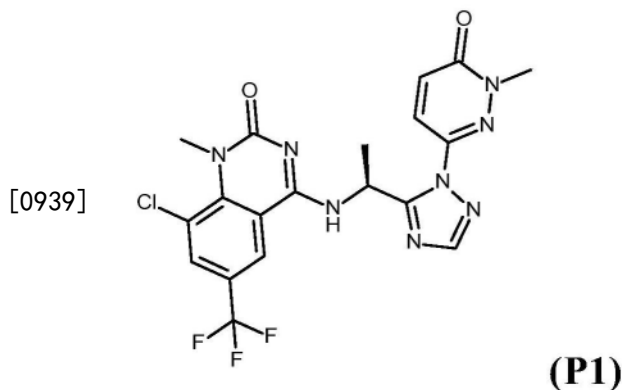


[0935] 在50mL RBF中,将8-氯-1-甲基-4-硫代-6-(三氟甲基)喹唑啉-2-酮(I-2) (0.62g, 1.262mmol, 60质量%)添加到乙腈(12.4mL)中,然后添加碘甲烷(0.900g, 6.3119mmol)和碳酸二铯(1.23g, 3.787mmol)。将反应物在室温下搅拌20h。通过TLC监测反应并确认转化。将反应物通过硅藻土床过滤、用EtOAc洗涤,并且浓缩滤液以得到粗品。将粗品吸附在硅胶上并使用硅胶柱通过combiflash纯化并用EtOAc在环己烷中的梯度体系洗脱。将所需级分浓缩以提供呈白色固体的8-氯-1-甲基-4-甲基硫烷基-6-(三氟甲基)喹唑啉-2-酮(0.2g, 0.648mmol, 产率51.3%)。

[0936]  $^1H$  NMR (400MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$ : 8.16 (s, 1H), 7.94 (d, 1H), 4.01 (s, 3H), 2.72 (s, 3H)。

[0937] LCMS(方法2):保留时间0.96min,  $m/z$  309.1  $[M+H]^+$ 。

[0938] 步骤D: 8-氯-1-甲基-4-[[ (1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基]-6-(三氟甲基)喹唑啉-2-酮(化合物P1)的制备

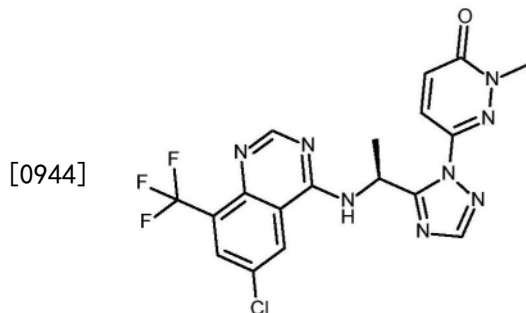


[0940] 在10mL微波小瓶中添加8-氯-1-甲基-4-甲基硫烷基-6-(三氟甲基)-喹唑啉-2-酮(I-3) (0.085g, 0.275mmol)、[(1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氯化铵(如下所述制备的化合物XX<sup>a1</sup>) (0.0848g, 0.330mmol)和乙酸(0.8908g, 0.85mL, 14.8mmol, 53.6equiv., 99.5质量%)。将小瓶密封并在微波中在120℃下加热60min。通过LCMS监测反应并确认转化。将反应物在旋转蒸发器上浓缩。将粗品吸附在硅藻土上并使用H<sub>2</sub>O:ACN在40g C18(40-60 $\mu$ m)上通过反相色谱法纯化。将产物级分冷冻干燥以提供呈白色固体的8-氯-1-甲基-4-[[ (1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基]-6-(三氟甲基)-喹唑啉-2-酮(0.065g, 49.1%产率)。

[0941]  $^1H$  NMR (400MHz, 乙腈- $d_3$ )  $\delta$ : 8.16 (d, 1H), 7.97-8.04 (m, 2H), 7.78-7.84 (m, 1H), 7.02 (d, 1H), 5.94 (q, 1H), 3.76 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 1.76 (d, 3H)。

[0942] LCMS(方法2):保留时间0.85min,m/z 481.2[M+H]<sup>+</sup>。

[0943] 实例P2:6-[5-[(1S)-1-[[6-氯-8-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(化合物P2)的制备



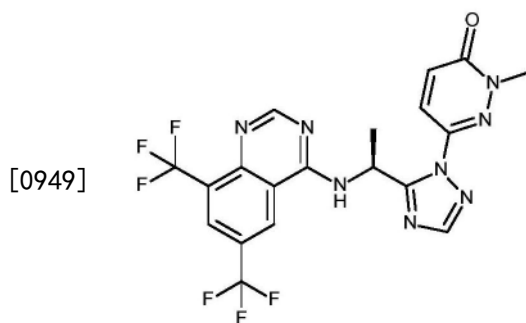
(P2)

[0945] 在室温下向[(1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氯化铵(如下所述制备的化合物XX<sup>a1</sup>) (0.2g,0.623mmol,80质量%) 和4,6-二氯-8-(三氟甲基)喹唑啉(CAS1565368-05-9) (0.208g,0.77915mmol) 在乙腈(4mL) 中的混合物中添加碳酸二铯Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (0.305g,0.934mmol)。将反应混合物在80℃下加热60min。通过LCMS监测反应并确认转化。通过过滤分离碳酸二铯并用罐洗涤固体。然后浓缩滤液。将粗品吸附在硅胶上并使用硅胶柱通过combiflash纯化并然后用EtOAc在环己烷中的梯度体系洗脱。将所需级分浓缩以提供呈白色固体的6-[5-[(1S)-1-[[6-氯-8-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(0.2g,产率64%)。

[0946] <sup>1</sup>H NMR (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ:9.04 (d, 1H), 8.82 (d, 1H), 8.45 (s, 1H), 8.21 (d, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 5.91 (quin, 1H), 3.48 (s, 3H), 1.75 (d, 3H)。

[0947] LCMS(方法2):保留时间1.02min,m/z 451.2[M+H]<sup>+</sup>。

[0948] 实例P3:6-[5-[(1S)-1-[[6,8-双(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(化合物P3)的制备



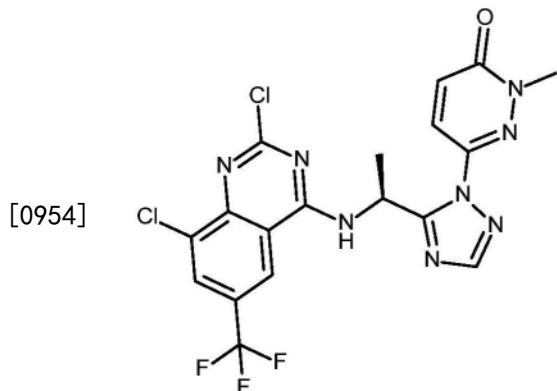
(P3)

[0950] 在室温下向4-氯-6,8-双(三氟甲基)喹唑啉(CAS2641011-24-5) (0.234g, 0.779mmol) 和[(1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氯化铵(如下所述制备的化合物XX<sup>a1</sup>) (0.2g,0.623mmol) 在乙腈(4mL) 中混合物中添加碳酸二铯(0.304g,0.934mmol)。将反应混合物在80℃下加热60min。通过LCMS监测反应并确认转化。通过过滤分离Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>并用罐洗涤固体。浓缩滤液。将粗品吸附在硅胶上并使用硅胶柱通过combiflash纯化并然后用EtOAc在环己烷中的梯度体系洗脱。将所需级分浓缩以提供呈白色固体的6-[5-[(1S)-1-[[6,8-双(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(0.15g,产率49.6%)。

[0951]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz, 乙腈- $\text{d}_3$ )  $\delta$ : 8.53 (s, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.37 (br d, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.12 (s, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.09 (d, 1H), 6.04 (quin, 1H), 3.67 (s, 3H), 1.86 (d, 3H)。

[0952] LCMS (方法2): 保留时间 0.91 min,  $m/z$  485.2  $[\text{M}+\text{H}]^+$ 。

[0953] 实例P4: 6-[5-[(1S)-1-[[2,8-二氯-6-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮 (化合物P4) 的制备

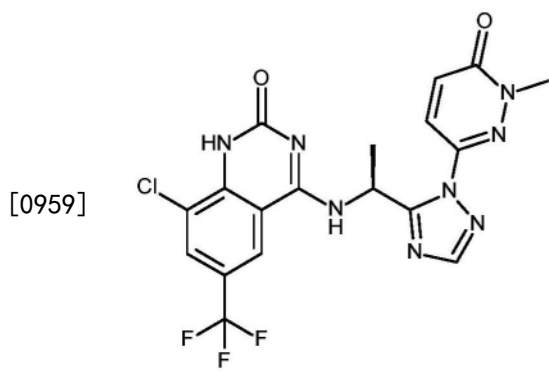


[0955] 向2,4,8-三氯-6-(三氟甲基)喹唑啉 (CAS2673195-86-1) (0.258g, 0.857mmol) 和 [(1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氯化铵 (如下所述制备的化合物XX<sup>a1</sup>) (0.2g, 0.779mmol) 在乙腈 (4mL) 中混合物中添加碳酸二铯 (0.38g, 1.1687mmol)。将反应混合物在80℃下加热15min。通过LCMS监测反应并确认转化。通过过滤分离 $\text{Cs}_2\text{CO}_3$ 并用ACN洗涤固体,并浓缩滤液。将粗品吸附在硅胶上并使用硅胶柱通过 combiflash 纯化并然后用EtOAc在环己烷中的梯度体系洗脱。将所需级分浓缩以提供呈白色固体的6-[5-[(1S)-1-[[2,8-二氯-6-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮 (0.22g, 产率54.7%)。

[0956]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{DMSO}-\text{d}_6$ )  $\delta$ : 9.75 (br d, 1H), 8.88 (s, 1H), 8.34 (s, 1H), 8.24 (s, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.15 (d, 1H), 5.93-6.00 (m, 1H), 3.54 (s, 3H), 1.76 (d, 3H)。

[0957] LCMS (方法2): 保留时间 1.10 min,  $m/z$  485.2  $[\text{M}+\text{H}]^+$ 。

[0958] 实例P5: 8-氯-4-[[[(1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基]-6-(三氟甲基)-1H-喹唑啉-2-酮 (化合物P5) 的制备



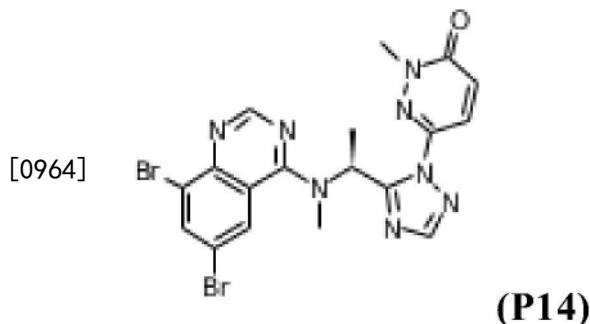
[0960] 在25ml RBF中装入6-[5-[(1S)-1-[[2,8-二氯-6-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮 (化合物P4) (0.2g, 0.412mmol) 和乙酸 (2mL, 99.5质量%)。然后将反应物在80℃下加热45分钟。通过LCMS监测反应并确认转化。将反应

物在旋转蒸发器上浓缩。将粗品吸附在硅藻土上并在40g C18(40-60 $\mu$ m)上通过反相柱色谱法纯化并且使用H<sub>2</sub>O和ACN(0.01% TFA)洗脱。将产物级分冷冻干燥并且进一步通过制备型HPLC纯化以得到呈白色固体的8-氯-4-[[[(1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基]-6-(三氟甲基)-1H-喹唑啉-2-酮(0.1g, 51.9%)。

[0961] <sup>1</sup>H NMR(400MHz, 乙腈-d<sub>3</sub>)  $\delta$ : 8.82(br s, 1H), 8.15(s, 1H), 8.04(s, 1H), 7.96(s, 1H), 7.82(d, 1H), 7.73(br d, 1H), 7.01(d, 1H), 5.96(quin, 1H), 3.66(s, 3H), 1.76(d, 3H)。

[0962] LCMS(方法2): 保留时间0.81min, m/z 467.2[M+H]<sup>+</sup>。

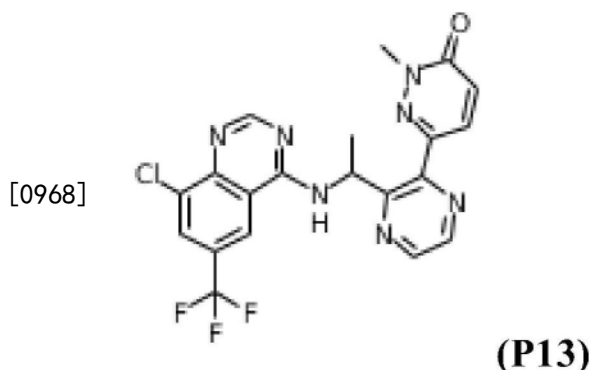
[0963] 实例P6: 6-[5-[(1S)-1-[(6,8-二溴喹唑啉-4-基)-甲基-氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(化合物P14)的制备



[0965] 在室温下向6-[5-[(1S)-1-[(6,8-二溴喹唑啉-4-基)氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(化合物P18)(0.1g, 0.198mmol)和碳酸铯(0.193g, 0.592mmol)在乙腈(1.5mL)中的混合物中添加碘甲烷(0.141g, 0.98mmol)。将反应混合物在室温下搅拌4小时,然后用水稀释并将产物用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层用盐水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并浓缩。将残余物通过combiflash(乙酸乙酯/环己烷)纯化以提供呈淡黄色固体的6-[5-[(1S)-1-[(6,8-二溴喹唑啉-4-基)-甲基-氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮。LCMS(方法3): 保留时间1.09min, m/z 519/521/523[M+H]<sup>+</sup>。

[0966] <sup>1</sup>H NMR(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 8.62(s, 1H), 8.16(d, 1H), 8.01(s, 1H), 7.93(d, 1H), 7.81(d, 1H), 7.09(d, 1H), 6.47(q, 1H), 3.37(s, 3H), 3.26(s, 3H), 1.88(d, 3H)。

[0967] 实例P7: 6-[3-[1-[[8-氯-6-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(化合物P13)的制备



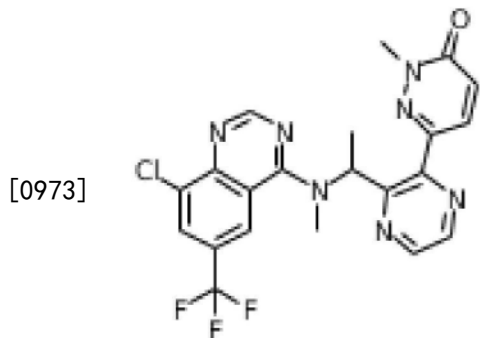
[0969] 在室温下向4,8-二氯-6-(三氟甲基)喹唑啉(类似于WO 2021/083936中找到的说明制备)(0.162g, 0.605mmol)和6-[3-(1-氨基乙基)吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(如下所述制备的化合物XX<sup>cl</sup>)(0.140g, 0.605mmol)在四氢呋喃(2mL)中的溶液中添加三乙胺(0.308g, 3.027mmol)。将反应混合物在微波中在100℃下加热1小时,然后在真空中浓缩。将

残余物通过combiflash(乙酸乙酯/环己烷)纯化以提供呈白色固体的6-[3-[1-[[8-氯-6-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮。

[0970] LCMS(方法2):保留时间0.88min,m/z 462/464[M+H]<sup>+</sup>。

[0971] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,CDCl<sub>3</sub>)δ:8.73(s,1H),8.60-8.67(m,2H),8.17(d,1H),8.04(d,2H),7.53(br d,1H),7.13(d,1H),6.47(quin,1H),4.00(s,3H),1.75(d,3H)。

[0972] 实例P8:6-[3-[1-[[8-氯-6-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]-甲基-氨基]乙基]吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(化合物P12)的制备



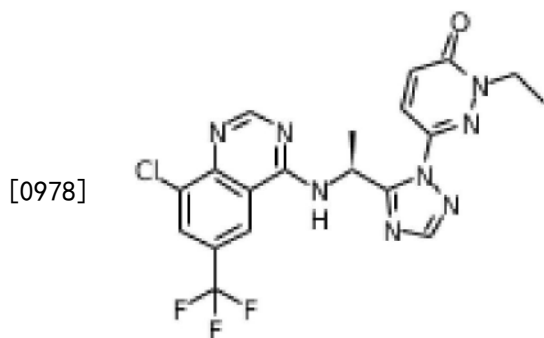
(P12)

[0974] 在室温下向6-[3-[1-[[8-氯-6-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(化合物P13)(0.075g,0.162mmol)和碳酸铯(0.159g,0.487mmol)在乙腈(1.5mL)中的混合物中添加碘甲烷(0.116g,0.812mmol)。将反应混合物在室温下搅拌4小时,然后用水稀释并将产物用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层用盐水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并浓缩。将残余物通过combiflash(乙酸乙酯/环己烷)纯化以提供呈淡黄色固体的6-[3-[1-[[8-氯-6-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]-甲基-氨基]乙基]吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮。

[0975] LCMS(方法3):保留时间1.14min,m/z 474/476[M-H]<sup>-</sup>。

[0976] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,CDCl<sub>3</sub>)δ:8.51-8.59(m,3H),8.10(s,1H),7.99(s,1H),7.98(d,1H),7.04(d,1H),6.55(q,1H),3.55(s,3H),3.54(s,3H),1.90(d,3H)。

[0977] 实例P9:6-[5-[(1S)-1-[[8-氯-6-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-乙基-哒嗪-3-酮(化合物P17)的制备



(P17)

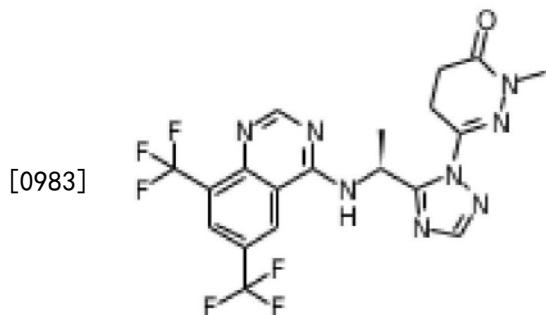
[0979] 在室温下向4,8-二氯-6-(三氟甲基)喹唑啉(类似于W0 2021/083936中找到的说明制备)(0.271g,1.016mmol)和[(1S)-1-[2-(1-乙基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氯化铵(如下所述制备的化合物XX<sup>a2</sup>)(0.250g,0.924mmol)在四氢呋喃(5mL)中的溶液中添加三乙胺(0.470g,4.617mmol)。将反应混合物在微波中在100℃下加热1小时,然

后在真空中浓缩。将残余物通过combiflash(乙酸乙酯/环己烷)纯化以提供呈白色固体的6-[5-[(1S)-1-[[8-氯-6-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-乙基-哒嗪-3-酮。

[0980] LCMS(方法3):保留时间1.10min, $m/z$  463/465[M-H]<sup>-</sup>。

[0981] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ :8.72(br d,1H),8.48(s,1H),8.11(s,1H),7.96(d,1H),7.83(s,1H),7.81(s,1H),7.24(d,1H),6.14(quin,1H),4.31(q,2H),1.92(d,3H),1.49(t,3H)。

[0982] 实例P10:6-[5-[(1S)-1-[[6,8-双(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-4,5-二氢哒嗪-3-酮(化合物P7)的制备



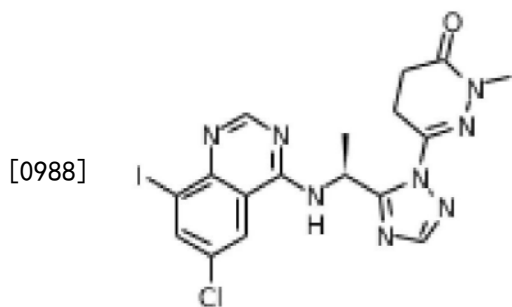
(P7)

[0984] 向6-[5-[(1S)-1-[[6,8-双(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(化合物P3)(0.06g,0.124mmol)在甲醇(3mL)中的脱气的溶液中添加钯碳(0.132g)。将反应混合物在氢气球气氛下在室温下搅拌20小时,然后通过硅藻土床过滤。将硅藻土床用MeOH洗涤并且将合并的滤液在减压下浓缩。将残余物通过combiflash(乙酸乙酯/环己烷)纯化以提供呈白色固体的6-[5-[(1S)-1-[[6,8-双(三氟甲基)-喹唑啉-4-基]氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-4,5-二氢哒嗪-3-酮。

[0985] LCMS(方法3):保留时间1.11min, $m/z$  487[M+H]<sup>+</sup>。

[0986] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,乙腈-d<sub>3</sub>)  $\delta$ :8.65(s,1H),8.57(s,1H),8.25(s,1H),8.18(br d,1H),8.01(s,1H),6.19(quin,1H),3.20-3.41(m,5H),2.71(t,2H),1.81(d,3H)。

[0987] 实例P11:6-[5-[(1S)-1-[(6-氯-8-碘代-喹唑啉-4-基)氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-4,5-二氢哒嗪-3-酮(化合物P25)的制备



(P25)

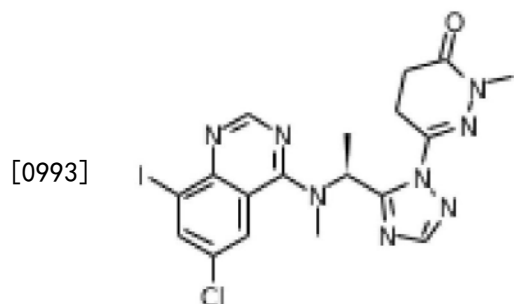
[0989] 在室温下向4,6-二氯-8-碘代-喹唑啉(CAS100949-33-5)(0.165g,0.508mmol)和[(1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-4,5-二氢哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氯化铵(如下所述制备的化合物XX<sup>b1</sup>)(0.144g,0.559mmol)在四氢呋喃(4mL)中的溶液中添加三乙胺(0.258g,2.53mmol)。将反应混合物在微波中在100℃下加热1小时,然后在真空中浓缩。将

残余物通过combiflash(乙酸乙酯在环己烷中)纯化以提供呈白色固体的6-[5-[(1S)-1-[(6-氯-8-碘代-喹唑啉-4-基)氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-4,5-二氢哒嗪-3-酮。

[0990] LCMS(方法3):保留时间1.06min,m/z 511/513[M+H]<sup>+</sup>。

[0991] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,CDCl<sub>3</sub>) δ:8.52(s,1H),8.24(s,1H),8.03(s,2H),7.61(s,1H),6.05-6.11(m,1H),3.27-3.56(m,4H),3.29-3.46(m,1H),2.78-2.94(m,2H),1.82(d,3H)。

[0992] 实例P12:6-[5-[(1S)-1-[(6-氯-8-碘代-喹唑啉-4-基)-甲基-氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-4,5-二氢哒嗪-3-酮(化合物P26)的制备



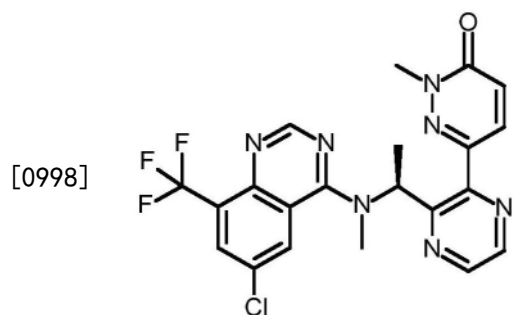
(P26)

[0994] 在室温下向6-[5-[(1S)-1-[(6-氯-8-碘代-喹唑啉-4-基)氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-4,5-二氢哒嗪-3-酮(化合物P25)(0.140g,0.274mmol)和碳酸铯(0.268g,0.822mmol)在乙腈(2mL)中的混合物中添加碘甲烷(0.196g,1.371mmol)。将反应混合物在室温下搅拌4小时,然后用水稀释并将产物用乙酸乙酯萃取。将合并的有机层用盐水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将残余物通过combiflash(乙酸乙酯在环己烷中)纯化以提供呈白色固体的6-[5-[(1S)-1-[(6-氯-8-碘代-喹唑啉-4-基)-甲基-氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-4,5-二氢哒嗪-3-酮。

[0995] LCMS(方法3):保留时间1.10min,m/z 525/527[M+H]<sup>+</sup>。

[0996] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,CDCl<sub>3</sub>) δ:8.66(s,1H),8.29(d,1H),7.94(s,1H),7.91(d,1H),6.48(q,1H),3.39(s,3H),3.23-3.37(m,2H),2.82(s,3H),2.60-2.75(m,2H),1.84(d,3H)。

[0997] 实例P13:6-[3-[(1S)-1-[[6-氯-8-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]-甲基-氨基]乙基]吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(化合物P27)的制备



(P27)

[0999] 将外消旋6-[3-[1-[[6-氯-8-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]-甲基-氨基]乙基]吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(化合物P21)混合物(65mg)使用下文概述的条件通过制备型SFC进行手性拆分。

[1000] 制备方法:

[1001] Sepiatec Prep SFC 100;柱:Daicel **CHIRALPAK®** 0Z, 5 $\mu$ m, 2.0cm $\times$ 25cm; 流动相:A:CO<sub>2</sub> B:MeOH等度:20% B;背压:150巴;GLS:-;流速:60ml/min;检测:UV 290nm; 样品浓度:65mg在2ml MeOH/DCM(1/1)中;注射:350 $\mu$ l。

[1002] 结果(手性分析方法5):

[1003]

| 第一洗脱对映异构体                         | 第二洗脱对映异构体 (化合物 P27)               |
|-----------------------------------|-----------------------------------|
| 保留时间 (min) 约 2.54                 | 保留时间 (min) 约 4.03                 |
| 化学纯度 (在 290 nm 处的面积%) 98          | 化学纯度 (在 290 nm 处的面积%) > 99        |
| 对映异构体过量 (%) > 99                  | 对映异构体过量 (%) > 99                  |
| [M+H] <sup>+</sup> (测量的): 476/478 | [M+H] <sup>+</sup> (测量的): 476/478 |
| 量: 26.5 mg                        | 量: 32.2 mg                        |

[1004] 表P:具有式(I)的化合物的物理数据(\*[M+H]<sup>+</sup>测量的;\*\*使用的方法)

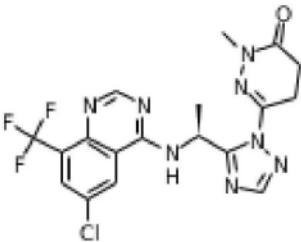
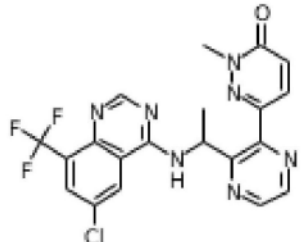
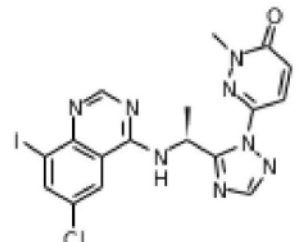
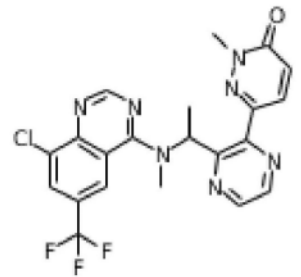
[1005]

| 条目 | IUPAC 名称                                                                       | 结构 | RT<br>(min) | [M+<br>H] <sup>+</sup><br>* | Met<br>h.<br>** | MP<br>(°C)<br>) |
|----|--------------------------------------------------------------------------------|----|-------------|-----------------------------|-----------------|-----------------|
| P1 | 8-氯-1-甲基-4-[[[(1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基]-6-(三氟甲基)喹唑啉-2-酮 |    | 0.85        | 481.2                       | 2               | 112-116         |
| P2 | 6-[5-[(1S)-1-[[6-氯-8-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮            |    | 1.02        | 451.2                       | 2               | 147-151         |
| P3 | 6-[5-[(1S)-1-[[6,8-双(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮             |    | 0.91        | 485.2                       | 2               | 134-138         |
| P4 | 6-[5-[(1S)-1-[[2,8-二氯-6-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮         |    | 1.10        | 485.2                       | 2               | 163-167         |

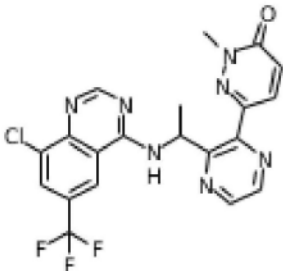
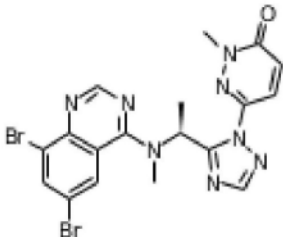
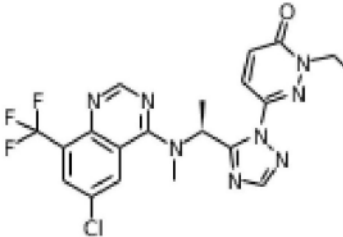
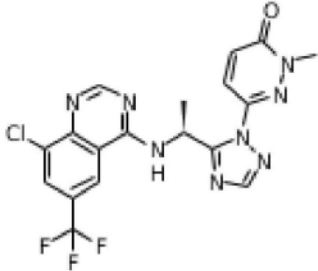
[1006]

| 条<br>目 | IUPAC 名称                                                                                                   | 结构 | RT<br>(m<br>in) | [M+<br>H] <sup>+</sup><br>* | Met<br>h.<br>** | MP<br>(°C<br>) |
|--------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----|-----------------|-----------------------------|-----------------|----------------|
| P5     | 8-氯<br>-4-[[[(1S)-1-[2-(1-<br>甲基-6-氧代-哒嗪<br>-3-基)-1,2,4-三唑<br>-3-基]乙基]氨基<br>基]-6-(三氟甲<br>基)-1H-喹唑啉-2-<br>酮 |    | 0.81            | 467.2                       | 2               | -              |
| P6     | 6-[5-[(1S)-1-[[6-<br>氯-8-(三氟甲基)<br>喹唑啉-4-基]-甲<br>基-氨基]乙<br>基]-1,2,4-三唑-1-<br>基]-2-甲基-哒嗪<br>-3-酮            |    | 1.13            | 465/4<br>67                 | 3               | 93 -<br>95     |
| P7     | 6-[5-[(1S)-1-[[6,8-<br>双(三氟甲基)喹<br>唑啉-4-基]氨基]<br>乙基]-1,2,4-三唑<br>-1-基]-2-甲基<br>-4,5-二氢哒嗪-3-<br>酮           |    | 1.11            | 487                         | 3               | 133 -<br>137   |
| P8     | 6-[3-[1-[[6,8-双<br>(三氟甲基)喹唑<br>啉-4-基]氨基]乙<br>基]吡嗪-2-基]-2-<br>甲基-哒嗪-3-酮                                     |    | 0.97            | 496                         | 3               | 215 -<br>217   |

[1007]

| 条<br>目 | IUPAC 名称                                                                                         | 结构                                                                                   | RT<br>(m<br>in) | [M+<br>H] <sup>+</sup><br>*           | Met<br>h.<br>** | MP<br>(°C<br>) |
|--------|--------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------|-----------------|---------------------------------------|-----------------|----------------|
| P9     | 6-[5-[(1S)-1-[[6-<br>氯-8-(三氟甲基)<br>喹唑啉-4-基]氨基<br>乙基]-1,2,4-三<br>唑-1-基]-2-甲基<br>-4,5-二氢哒嗪-3-<br>酮 |    | 1.06            | 453/4<br>55                           | 3               | 209 -<br>211   |
| P10    | 6-[3-[1-[[6-氯<br>-8-(三氟甲基)喹<br>唑啉-4-基]氨基]<br>乙基]吡嗪-2-<br>基]-2-甲基-哒嗪<br>-3-酮                      |    | 1.45            | 462/4<br>64                           | 4               | 218 -<br>220   |
| P11    | 6-[5-[(1S)-1-[(6-<br>氯-8-碘代-喹唑啉<br>-4-基)氨基]乙<br>基]-1,2,4-三唑-1-<br>基]-2-甲基-哒嗪<br>-3-酮             |   | 1.02            | 509/5<br>11                           | 3               | 203 -<br>205   |
| P12    | 6-[3-[1-[[8-氯<br>-6-(三氟甲基)喹<br>唑啉-4-基]-甲基-<br>氨基]乙基]吡嗪<br>-2-基]-2-甲基-哒<br>嗪-3-酮                  |  | 1.14            | 474/4<br>76<br>[M-<br>H] <sup>-</sup> | 3               | 157 -<br>159   |

[1008]

| 条目  | IUPAC 名称                                                                | 结构                                                                                   | RT<br>(min) | [M+<br>H] <sup>+</sup><br>* | Met<br>h.<br>** | MP<br>(°C) |
|-----|-------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-----------------------------|-----------------|------------|
| P13 | 6-[3-[1-[[8-氯-6-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮                 |    | 0.88        | 462/464                     | 3               | 240 - 242  |
| P14 | 6-[5-[(1S)-1-[(6,8-二溴喹唑啉-4-基)-甲基-氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮       |    | 1.09        | 519/521/523                 | 3               | 74 - 76    |
| P15 | 6-[5-[(1S)-1-[[6-氯-8-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]-甲基-氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-乙基-哒嗪-3-酮 |   | 1.18        | 479/481                     | 3               | 94 - 96    |
| P16 | 6-[5-[(1S)-1-[[8-氯-6-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮     |  | 1.05        | 451/453                     | 3               | -          |

[1009]

| 条目  | IUPAC 名称                                                            | 结构 | RT<br>(min) | [M+H] <sup>+</sup><br>*           | Met<br>h.<br>** | MP<br>(°C) |
|-----|---------------------------------------------------------------------|----|-------------|-----------------------------------|-----------------|------------|
| P17 | 6-[5-[(1S)-1-[[8-氯-6-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-乙基-哒嗪-3-酮 |    | 1.10        | 463/465<br>[M-H] <sup>-</sup>     | 3               | 116 - 118  |
| P18 | 6-[5-[(1S)-1-[(6,8-二溴喹唑啉-4-基)氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮       |    | 1.04        | 503/505/507<br>[M-H] <sup>-</sup> | 3               | 259 - 261  |
| P19 | 6-[5-[(1S)-1-[[6-氯-8-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-乙基-哒嗪-3-酮 |    | 1.11        | 463/465[M-H] <sup>-</sup>         | 3               | 116 - 118  |
| P20 | 6-[5-[(1S)-1-[(8-氯-6-碘代-喹唑啉-4-基)氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮    |    | 1.05        | 507/509[M-H] <sup>-</sup>         | 3               | -          |
| P21 | 6-[3-[1-[[6-氯-8-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]-甲基-氨基]乙基]吡嗪-2-基]-2-甲基-哒              |    | 1.17        | 474/476[M-H] <sup>-</sup>         | 3               | 144 - 146  |

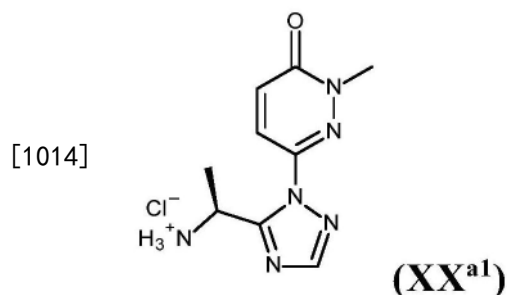
[1010]

| 条目  | IUPAC 名称                                                                      | 结构 | RT<br>(min) | [M+H] <sup>+</sup><br>*   | Met<br>h.<br>** | MP<br>(°C) |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------|----|-------------|---------------------------|-----------------|------------|
|     | 噻-3-酮                                                                         |    |             |                           |                 |            |
| P22 | 6-[5-[(1S)-1-[[8-氯-6-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]-甲基-氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-乙基-哒嗪-3-酮       |    | 1.14        | 477/479[M-H] <sup>-</sup> | 3               | 64 - 66    |
| P23 | 6-[5-[(1S)-1-[[8-氯-6-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]-甲基-氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮       |    | 1.11        | 463/465[M-H] <sup>-</sup> | 3               | 107 - 109  |
| P24 | 6-[5-[(1S)-1-[[6-氯-8-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]-甲基-氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-4,5-二氢哒嗪-3-酮 |    | 1.11        | 467/469                   | 3               | 70 - 72    |
| P25 | 6-[5-[(1S)-1-[(6-氯-8-碘代-喹唑啉-4-基)氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-4,5-二氢哒嗪-3-酮        |    | 1.06        | 511/513                   | 3               | 236 - 238  |

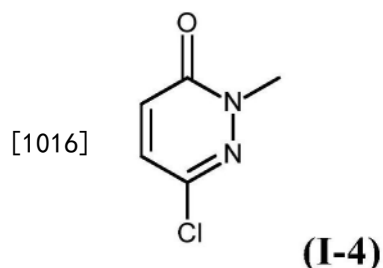
| 条目         | IUPAC 名称                                                                   | 结构 | RT<br>(min) | [M+H] <sup>+</sup><br>*   | Met<br>h.<br>** | MP<br>(°C) |
|------------|----------------------------------------------------------------------------|----|-------------|---------------------------|-----------------|------------|
| [1011] P26 | 6-[5-[(1S)-1-[(6-氯-8-碘代-喹唑啉-4-基)-甲基-氨基]乙基]-1,2,4-三唑-1-基]-2-甲基-4,5-二氢哒嗪-3-酮 |    | 1.10        | 525/527                   | 3               | 92 - 94    |
| P27        | 6-[3-[(1S)-1-[[6-氯-8-(三氟甲基)喹唑啉-4-基]-甲基-氨基]乙基]吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮           |    | 4.03        | 476/478[M+H] <sup>+</sup> | 5               | -          |

[1012] 中间体的制备

[1013] 实例PI-1: [(1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氯化铵(化合物XX<sup>a1</sup>)的制备



[1015] 步骤A: 6-氯-2-甲基-哒嗪-3-酮(I-4)的制备

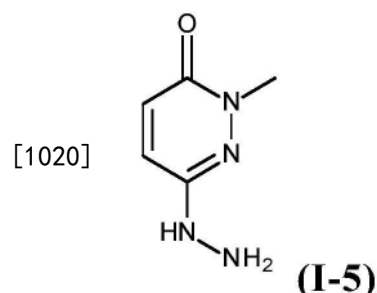


[1017] 向6-氯哒嗪-3-醇(CAS19064-67-6) (1.00g, 7.661mmol, 1.00equiv.) 在乙腈(10mL) 中的溶液中添加碳酸钾(3.21g, 22.98mmol, 3.00equiv.), 随后添加碘甲烷(0.584mL, 9.193mmol, 1.20equiv.). 将反应在室温下搅拌48小时。然后, 添加水, 并且将水层用乙酸乙酯萃取。然后, 将有机层用盐水洗涤、经硫酸钠干燥、过滤并在减压下浓缩以提供呈棕色固体的所需化合物, 6-氯-2-甲基-哒嗪-3-酮。LCMS(方法1): 保留时间0.39min, m/

z 145/147  $[M+H]^+$ 。

[1018]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm 7.20 (d,  $J=9.66\text{Hz}$ , 1H), 6.92 (d,  $J=9.66\text{Hz}$ , 1H), 3.75 (s, 3H)。

[1019] 步骤B: 6-胍基-2-甲基-哒嗪-3-酮 (I-5) 的制备



[1021] 在室温下向装有6-氯-2-甲基-哒嗪-3-酮 (I-4) (4.5g, 31.129mmol) 的25ml RBF中添加甲氧基环戊烷 (CPME) (45mL), 并且然后添加水合肼 (7.79g, 155.64mmol)。将反应混合物在100℃下加热1小时 (双相反应混合物)。使反应混合物冷却至室温。分离CPME层, 并使用分液漏斗用TBME洗涤残余物层。将残余物层在50℃下浓缩, 并将获得的粗品吸附在硅藻土上并且然后通过combiflash (硅胶柱, 用EtOAc/MeOH洗脱) 纯化。将产物在95:5EtOAc/MeOH中洗脱以得到呈白色固体的6-胍基-2-甲基-哒嗪-3-酮 (2.5g, 14mmol, 46%)。

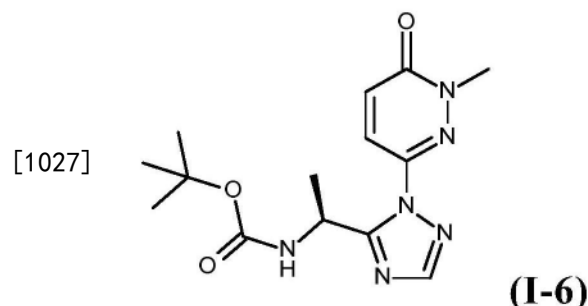
[1022] LCMS (方法2): 保留时间0.14min,  $m/z$  141.1  $[M+H]^+$ 。

[1023] 6-胍基-2-甲基-哒嗪-3-酮 (I-5) 的替代制备

[1024] 在氮气氛下, 向6-氯-2-甲基-哒嗪-3-酮 (I-4) (0.500g, 3.459mmol, 1.00equiv.) 在乙醇 (10.38mL) 中的溶液中添加水合肼 (0.845mL, 17.294mmol, 5.00equiv.)。将反应混合物在100℃下加热5小时。然后, 在减压下蒸发溶液, 并通过快速色谱法纯化残余物以提供所需化合物, 6-胍基-2-甲基-哒嗪-3-酮。LCMS (方法1): 保留时间0.29min。

[1025]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$ ppm 7.35-7.59 (m, 2H), 7.02 (d,  $J=9.66\text{Hz}$ , 1H), 6.74 (d,  $J=9.78\text{Hz}$ , 1H), 5.92 (s, 1H), 3.46 (s, 3H)。

[1026] 步骤C: N-[(1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基甲酸叔丁基酯 (I-6) 的制备

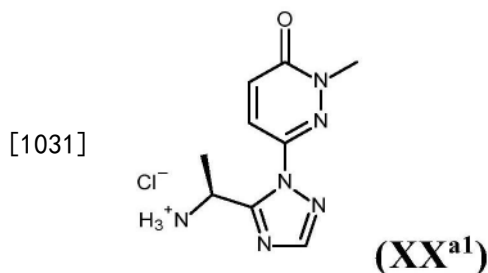


[1028] 向装有6-胍基-2-甲基-哒嗪-3-酮 (I-5) (2.5g, 14.271mmol) 的250mL RBF中添加 N-[(1S)-2-[(E)-二甲基氨基亚甲基氨基]-1-甲基-2-氧代-乙基]氨基甲酸叔丁基酯 (CAS2641011-39-2, 如例如W0 21/083936中所述制备) (4.16g, 17.126mmol)、1,4-二噁烷 (25mL)、分子筛  $4\text{ \AA}$  (5g) 和乙酸 (25mL)。添加后, 将反应物在80℃下加热5h。通过LCMS监测反应物进程。将反应混合物通过硅藻土床过滤, 将硅藻土床用EtOAc洗涤并将滤液浓缩。将

残余物用饱和 $\text{NaHCO}_3$ 水溶液稀释,并且将产物用 $\text{EtOAc}$  ( $100\text{mL} \times 3$ ) 萃取三次。将合并的有机层用盐水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并浓缩。将粗品吸附在二氧化硅上并通过combiflash纯化。将产物在 $80:20\text{EtOAc}$ /环己烷中洗脱以提供 $2.8\text{g}$ 产物,将其通过反相色谱法在 $40\text{g}$   $\text{C}_{18}$  ( $40\text{-}60\mu\text{m}$ ) 上进一步纯化,并使用 $\text{H}_2\text{O}/\text{ACN}$ 洗脱。将产物级分冷冻干燥以得到呈白色固体的 $\text{N}-[(1\text{S})\text{-}1\text{-}[2\text{-}(1\text{-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基})\text{-}1,2,4\text{-三唑-3-基}]\text{乙基}]\text{氨基甲酸叔丁基酯}$  ( $1.2\text{g}, 3.0\text{mmol}, 21\%$ )。

[1029]  $^1\text{H}$  NMR ( $400\text{MHz}, \text{CDCl}_3$ )  $\delta$ :  $7.95(\text{s}, 1\text{H})$ ,  $7.86(\text{d}, 1\text{H})$ ,  $7.13(\text{d}, \text{J}=9.9\text{Hz}, 1\text{H})$ ,  $5.46\text{-}5.55(\text{m}, 1\text{H})$ ,  $5.42(\text{br}, 1\text{H})$ ,  $3.84(\text{s}, 3\text{H})$ ,  $1.54\text{-}1.64(\text{d}, 3\text{H})$ ,  $1.42(\text{s}, 9\text{H})$ 。

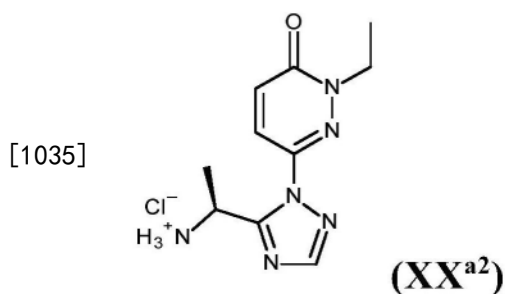
[1030] 步骤D:  $[(1\text{S})\text{-}1\text{-}[2\text{-}(1\text{-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基})\text{-}1,2,4\text{-三唑-3-基}]\text{乙基}]\text{氯化胺}$  (化合物 $\text{XX}^{\text{a1}}$ ) 的制备



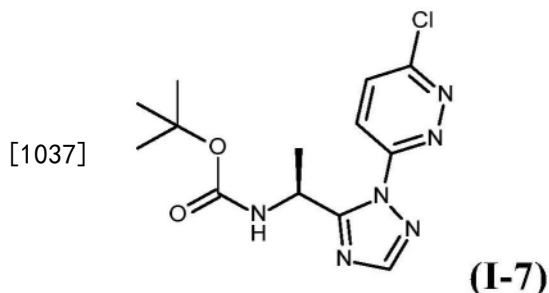
[1032] 在 $50\text{mL}$ 反应烧瓶中,将 $\text{N}-[(1\text{S})\text{-}1\text{-}[2\text{-}(1\text{-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基})\text{-}1,2,4\text{-三唑-3-基}]\text{乙基}]\text{氨基甲酸叔丁基酯}$  (I-6) ( $1.5\text{g}, 3.745\text{mmol}$ ) 溶解在 $\text{CPME}$  ( $15\text{mL}$ ) 中,并且然后在室温下将盐酸(在二噁烷中 $4\text{M}$ ) ( $14.04\text{mL}, 56.18\text{mmol}$ ) 添加到反应混合物中。将反应混合物在室温下搅拌 $18\text{h}$ ,在此时间期间沉淀出白色固体。通过LCMS监测反应进程。将反应物真空浓缩并将所得白色固体在 $\text{ACN}$  ( $20\text{mL}$ ) 中搅拌。通过过滤分离固体,并且在减压下干燥以得到呈白色固体的 $[(1\text{S})\text{-}1\text{-}[2\text{-}(1\text{-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基})\text{-}1,2,4\text{-三唑-3-基}]\text{乙基}]\text{氯化铵}$  ( $1.2\text{g}, 3.90\text{mmol}$ )。

[1033]  $^1\text{H}$  NMR ( $400\text{MHz}, \text{DMSO-d}_6$ )  $\delta_{\text{ppm}}$   $8.39(\text{s}, 1\text{H})$ ,  $7.93(\text{d}, 1\text{H})$ ,  $7.24(\text{d}, 1\text{H})$ ,  $5.07(\text{br}, 1\text{H})$ ,  $3.72(\text{s}, 3\text{H})$ ,  $1.63(\text{d}, 3\text{H})$ 。

[1034] 实例PI-2:  $[(1\text{S})\text{-}1\text{-}[2\text{-}(1\text{-乙基-6-氧代-哒嗪-3-基})\text{-}1,2,4\text{-三唑-3-基}]\text{乙基}]\text{氯化胺}$  (化合物 $\text{XX}^{\text{a2}}$ ) 的制备



[1036] 步骤A:  $\text{N}-[(1\text{S})\text{-}1\text{-}[2\text{-}(6\text{-氯哒嗪-3-基})\text{-}1,2,4\text{-三唑-3-基}]\text{乙基}]\text{氨基甲酸叔丁基酯}$  (I-7) 的制备

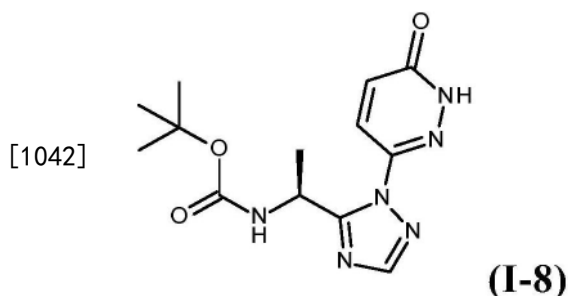


[1038] 向N-[(1S)-2-[(E)-二甲基氨基亚甲基氨基]-1-甲基-2-氧代-乙基]氨基甲酸叔丁基酯(CAS2641011-39-2,如例如在W0 21/083936中所述的制备)(5g,20.55mmol)在1,4-二噁烷(50mL)中的搅拌的溶液中添加3-氯-6-胍基哒嗪(CAS17284-97-8)(3.27g,22.61mmol),然后添加乙酸(50mL)。将反应混合物加热至80℃持续2小时,然后冷却至室温并且真空浓缩。将残余物用水稀释并将产物用EtOAc萃取。将合并的有机层用饱和碳酸氢钠水溶液、水和盐水洗涤,经硫酸钠干燥并在减压下浓缩。将粗品通过combiflash(环己烷中的梯度乙酸乙酯)纯化以提供N-[(1S)-1-[2-(6-氯哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基甲酸叔丁基酯(I-7)。

[1039] LCMS(方法2):保留时间0.98min,m/z 269/271[M+H-tBu]<sup>+</sup>,225/227[M+H-Boc]<sup>+</sup>。

[1040] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,CDCl<sub>3</sub>)δppm 8.13(d,1H),8.01(s,1H),7.72(d,1H),5.78(quin,1H),5.51(br s,1H),1.65(d,3H),1.39(s,9H)。

[1041] 步骤B:N-[(1S)-1-[2-(6-氧代-1H-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基甲酸叔丁基酯(I-8)的制备



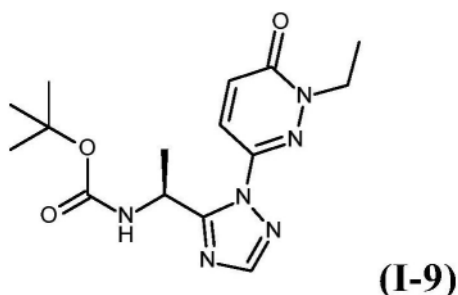
[1043] 向N-[(1S)-1-[2-(6-氯哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基甲酸叔丁基酯(I-7)(4.0g,12.32mmol)和(E)-苯甲醛肟(1.99g,16.01mmol)在N,N-二甲基甲酰胺(40mL)中的溶液中添加碳酸铯(10.03g,30.79mmol)。将反应混合物在100℃下搅拌2h,冷却至室温并用水稀释。将产物用在EtOAc中60% ACN充分萃取,将合并的有机层用盐水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并真空浓缩。将残余物通过combiflash(EtOAc)纯化以提供呈胶状物的N-[(1S)-1-[2-(6-氧代-1H-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基甲酸叔丁基酯(I-8)。

[1044] LCMS(方法2):保留时间0.84min,m/z 305[M-H]<sup>-</sup>。

[1045] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,DMSO-d<sub>6</sub>)δppm 13.29(s,1H),8.14(s,1H),7.73(d,1H),7.49(d,1H),7.13(d,1H),5.19(quin,1H),1.42(d,3H),1.30(s,9H)。

[1046] 步骤C:N-[(1S)-1-[2-(1-乙基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基甲酸叔丁基酯(I-9)的制备

[1047]

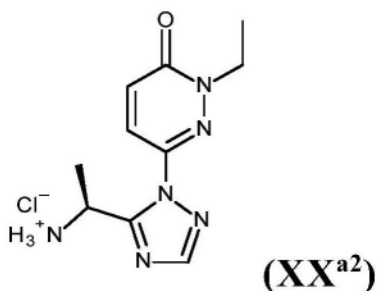


[1048] 将N-[(1S)-1-[2-(6-氧代-1H-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基甲酸叔丁基酯(I-8) (7.15g, 19.8mmol)、碳酸铯(6.47g, 19.8mmol)和碘乙烷(1.74mL, 21.8mmol)在乙腈(71.5mL)中的溶液在室温下搅拌30小时。将反应混合物通过硅藻土垫过滤并且将残余物用ACN洗涤。将滤液经硫酸钠干燥并在减压下浓缩。将粗产物通过combi flash(环己烷中的40%-50%梯度EtOAc)纯化以提供呈固体的N-[(1S)-1-[2-(1-乙基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基甲酸叔丁基酯。

[1049]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm 7.96(s, 1H), 7.85(d, 1H), 7.12(d, 1H), 5.52(m, 1H), 5.44(m, 1H), 4.22-4.33(m, 2H), 1.61(d, 3H), 1.47(t, 3H), 1.43(s, 9H)。

[1050] 步骤D: [(1S)-1-[2-(1-乙基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氯化胺(化合物XX<sup>a2</sup>)的制备

[1051]

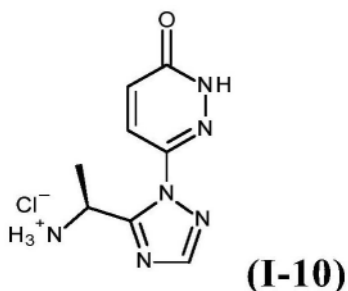


[1052] 向N-[(1S)-1-[2-(1-乙基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基甲酸叔丁基酯(I-9) (1.90g, 5.40mmol)在CPME(19mL)中的溶液中添加盐酸(在1,4-二噁烷中4M) (40.0mL, 160mmol),并将反应混合物在室温下搅拌12小时。添加额外的盐酸(在1,4-二噁烷中4M, 20equiv.)并在室温下继续搅拌12小时。将混合物在减压下浓缩以提供呈白色固体的[(1S)-1-[2-(1-乙基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氯化胺。

[1053]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$ ppm 8.76(br s, 3H), 8.40(s, 1H), 7.93(d, 1H), 7.24(d, 1H), 5.09(m, 1H), 4.15(q, 2H), 1.64(d, 3H), 1.33(t, 3H)。

[1054] 实例PI-3: [(1S)-1-[2-(6-氧代-1H-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氯化胺(化合物I-10)的制备

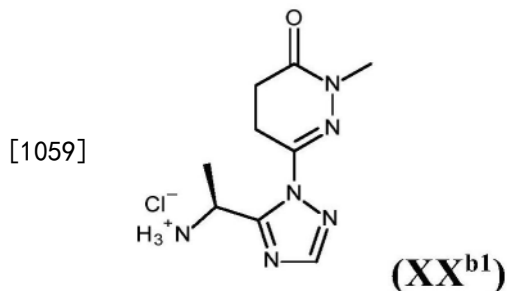
[1055]



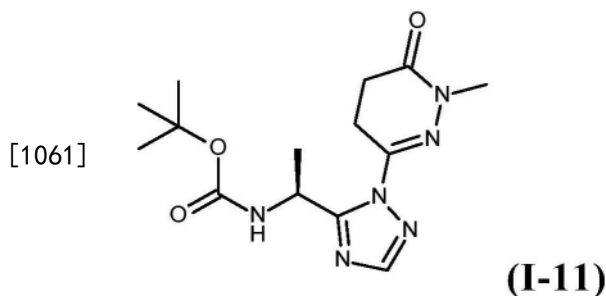
[1056] 在室温下向N-[(1S)-1-[2-(6-氧代-1H-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基甲酸叔丁基酯(I-8)(2g,5.88mmol,90质量%)在CPME(20mL)中的溶液中添加盐酸(在二噁烷中4M)(2.7mL),并将反应混合物搅拌12h。在进一步添加盐酸(在二噁烷中4M)(3.6mL)后,继续搅拌另外12h。将混合物真空浓缩并干燥以提供呈白色固体的[(1S)-1-[2-(6-氧代-1H-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氯化胺(I-10)。

[1057]  $^1\text{H}$  NMR(400MHz,DMSO- $d_6$ )  $\delta$ ppm 13.33(br s,1H),8.78(br s,3H),8.37(s,1H),7.88(d,1H),7.17(d,1H),4.99(quin,1H),1.59(d,3H)。

[1058] 实例PI-4: [(1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-4,5-二氢哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氯化胺(化合物XX<sup>b1</sup>)的制备



[1060] 步骤A: N-[(1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-4,5-二氢哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基甲酸叔丁基酯(I-11)的制备

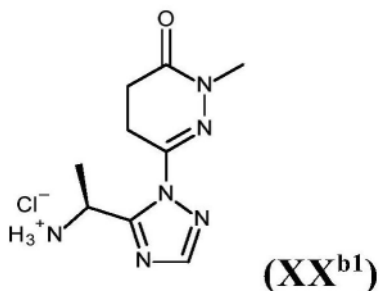


[1062] 将N-[(1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基甲酸叔丁基酯(化合物I-6,如上所述制备)(300mg,0.936mmol)在甲醇(15mL)中的溶液用氮气冲洗。添加钨碳(10%,199.3mg)并将反应混合物在氢气氛下在室温下搅拌36小时。将混合物通过硅藻土垫过滤,将残余物用甲醇洗涤并且将滤液真空浓缩。将粗产物通过combiflash(环己烷中的梯度EtOAc)纯化以提供呈胶状物的N-[(1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-4,5-二氢哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基甲酸叔丁基酯。LCMS(方法2):保留时间1.01min,m/z 323[M+H]<sup>+</sup>。

[1063]  $^1\text{H}$  NMR(400MHz,CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ ppm 7.88(s,1H),5.51(m,1H),5.43(m,1H),3.41(s,3H),3.22(m,2H),2.74(m,2H),1.54(d,3H),1.42(s,9H)。

[1064] 步骤B: [(1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-4,5-二氢哒嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氯化胺(化合物XX<sup>b1</sup>)的制备

[1065]



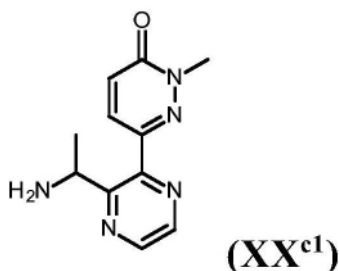
[1066] 向N-[(1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-4,5-二氢吡嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氨基甲酸叔丁基酯(I-11)(2.3g,7.1mmol)在1,4-二噁烷(19mL)中的溶液中添加盐酸(在1,4-二噁烷中4M)(19mL,76mmol),并将混合物在室温下搅拌5小时。将混合物在减压下浓缩并将残余物用TBME磨碎。将沉淀物过滤并且干燥以提供呈白色固体的[(1S)-1-[2-(1-甲基-6-氧代-4,5-二氢吡嗪-3-基)-1,2,4-三唑-3-基]乙基]氯化胺。

[1067] LCMS(方法2):保留时间0.23min, $m/z$  223[M+H]<sup>+</sup>(对于游离碱)。

[1068] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,DMSO-d<sub>6</sub>) $\delta$ ppm 8.79(br s,3H),8.30(s,1H),5.06(m,1H),3.29(s,3H),3.18-3.28(m,2H),2.69(m,2H),1.61(d,3H)。

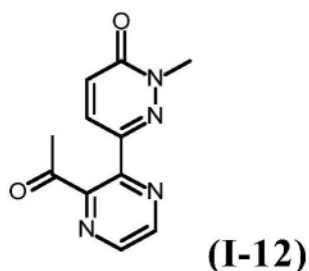
[1069] 实例PI-5:6-[3-(1-氨基乙基)吡嗪-2-基]-2-甲基-吡嗪-3-酮(化合物XX<sup>c1</sup>)的制备

[1070]



[1071] 步骤A:6-(3-乙酰基吡嗪-2-基)-2-甲基-吡嗪-3-酮(I-12)的制备

[1072]

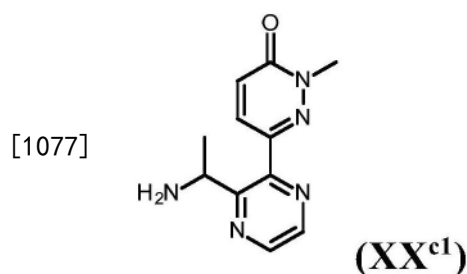


[1073] 向1-(3-氯吡嗪-2-基)乙酮(CAS121246-90-0)(3.75g,24.0mmol)在1,4-二噁烷(56.3mL)中的搅拌溶液中添加2-甲基-6-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷-2-基)吡嗪-3-酮(化合物I-16,如下所述制备)(6.79g,28.7mmol),随后添加碳酸铯(23.4g,71.9mmol)和1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁-二氯化钯(II)二氯甲烷络合物(1.96g,2.40mmol)。将反应混合物用氮气冲洗并在120℃下加热1小时。冷却至室温后,将混合物通过硅藻土垫过滤并且将滤液用乙酸乙酯稀释。将有机层用水和盐水洗涤、经硫酸钠干燥、过滤并在减压下浓缩。将残余物通过combiflash(环己烷中的梯度EtOAc)纯化以提供呈棕色固体的6-(3-乙酰基吡嗪-2-基)-2-甲基-吡嗪-3-酮。<sup>1</sup>H NMR(400MHz,CDCl<sub>3</sub>) $\delta$ ppm 8.67(d,1H),8.58(d,1H),8.03(d,1H),7.06(d,1H),3.80(s,3H),2.72(s,3H)。

[1074] 6-(3-乙酰基吡嗪-2-基)-2-甲基-哒嗪-3-酮(I-12)的替代制备:

[1075] 向在0℃下在氩气下的6-[3-(1-羟基乙基)吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(化合物I-14,如下所述制备)(100mg,0.431mmol)在乙腈(8.6mL)中的溶液中添加戴斯-马丁高碘烷(CAS 87413-09-0)(188.3mg,0.431mmol)。将反应混合物在0℃下搅拌80分钟,然后在室温下搅拌过夜。添加额外的戴斯-马丁高碘烷(56.5mg,0.129mmol)并在室温下继续搅拌另外2小时。将混合物通过添加硫代硫酸钠淬灭,然后用乙酸乙酯稀释并在室温下搅拌15分钟。滤出形成的白色沉淀物,并且将有机层用水、NaHCO<sub>3</sub>水溶液和盐水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并在减压下浓缩。将粗产物通过combiflash(环己烷中的梯度乙酸乙酯)纯化以提供呈固体的6-(3-乙酰基吡嗪-2-基)-2-甲基-哒嗪-3-酮。LCMS(方法3):保留时间0.53min,m/z 231[M+H]<sup>+</sup>。

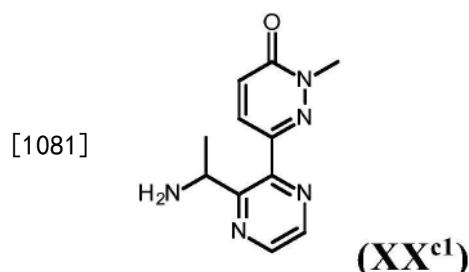
[1076] 步骤B:6-[3-(1-氨基乙基)吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(化合物XX<sup>c1</sup>)的制备



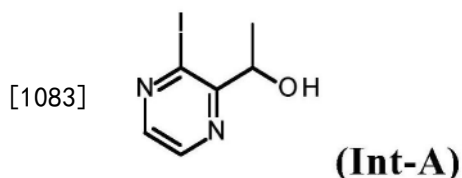
[1078] 向在室温下的6-(3-乙酰基吡嗪-2-基)-2-甲基-哒嗪-3-酮(I-12)(1.0g,4.34mmol)在氨(在甲醇中7M,3.1mL,21.7mmol)中的搅拌的溶液中滴加异丙醇钛(IV)(2.48mL,8.69mmol),并将反应混合物在室温下搅拌16小时。分批缓慢添加硼氢化钠(259mg,6.52mmol)并在室温下继续搅拌过夜。将混合物用水淬灭并在减压下浓缩。将残余物用甲醇(10mL)处理并搅拌5分钟,然后通过硅藻土垫过滤并将滤液真空浓缩。向残余物中添加2N HCl,浓缩混合物,将残余物溶解在甲醇中并添加固体碳酸钠。将混合物搅拌30分钟,小心倾析甲醇层并在减压下浓缩。将粗产物通过combiflash(乙酸乙酯中的梯度甲醇)纯化以提供呈固体的6-[3-(1-氨基乙基)吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮。LCMS(方法2):保留时间0.15min,m/z 232[M+H]<sup>+</sup>。

[1079] <sup>1</sup>H NMR(400MHz,CDC1<sub>3</sub>) δppm 8.61(d,1H),8.59(d,1H),8.15(d,1H),7.08(d,1H),5.26(m,1H),3.90(s,3H),1.74(d,3H)。

[1080] 实例PI-6:6-[3-(1-氨基乙基)吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(化合物XX<sup>c1</sup>)的替代制备



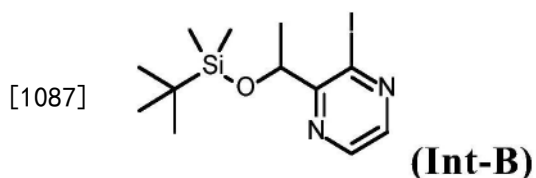
[1082] 步骤A:1-(3-碘代吡嗪-2-基)乙醇(Int-A)的制备



[1084] 在氩气氛下,将THF (35mL) 冷却至0℃。然后在0℃下添加2,2,6,6-四甲基哌啶 (5.4mL,30.9mmol,1.34equiv.),然后滴加2.5M n-BuLi (12mL,29.98mmol,1.3equiv.)。将反应混合物冷却至-78℃,然后滴加2-碘代吡嗪 (5.0g,23.06mmol,1.0equiv.) 在THF (5mL) 中的溶液。搅拌1小时后,在-78℃下滴加乙醛 (12mL,210mmol,9.2equiv.)。添加后,使反应混合物升温至室温,然后将其用饱和氯化铵水溶液淬灭。将反应混合物用水以及TBME和乙酸乙酯的混合物稀释。将水层用1M HCl酸化至pH 1-2。分离相并且将有机层用盐水洗涤,经硫酸钠干燥,过滤并在真空中浓缩。将粗萃取物通过快速色谱法(在环己烷中0%-10%乙酸乙酯)纯化以提供1-(3-碘代吡嗪-2-基)乙醇。

[1085] LCMS (方法3):保留时间0.54min,m/z 251[M+H]<sup>+</sup>。<sup>1</sup>H NMR (400MHz,CDCl<sub>3</sub>) δppm 8.47(d,1H),8.31(d,1H),5.10(dd,1H),3.66-3.73(m,1H),1.52(d,3H)。

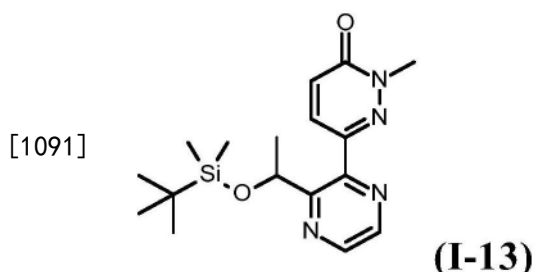
[1086] 步骤B:叔丁基-[1-(3-碘代吡嗪-2-基)乙氧基]-二甲基-硅烷(Int-B)的制备



[1088] 向1-(3-碘代吡嗪-2-基)乙醇(Int-A) (1.20g,4.80mmol,1.0equiv.) 在THF (10mL) 中的溶液中添加咪唑 (660mg,9.60mmol,2.0equiv.),然后添加叔丁基二甲基氯硅烷 (1.1mL,5.76mmol,1.2equiv.)。将所得反应混合物加热至50℃并在该温度下搅拌2小时,然后使其冷却至室温。过滤反应混合物。将滤饼用TBME洗涤,并且将滤液真空浓缩。将粗萃取物通过快速色谱法(在环己烷中0%-3%乙酸乙酯)纯化以提供叔丁基-[1-(3-碘代吡嗪-2-基)乙氧基]-二甲基-硅烷。

[1089] LCMS (方法3):保留时间1.30min,m/z 365[M+H]<sup>+</sup>。<sup>1</sup>H NMR (400MHz,CDCl<sub>3</sub>) δppm 8.52(d,1H),8.24(d,1H),5.31(q,1H),1.51(d,3H),0.88(s,9H),0.07(s,3H),0.05(s,3H)。

[1090] 步骤C:6-[3-[1-(叔丁基(二甲基)甲硅烷基)氧基乙基]吡嗪-2-基]-2-甲基-吡嗪-3-酮(I-13)的制备



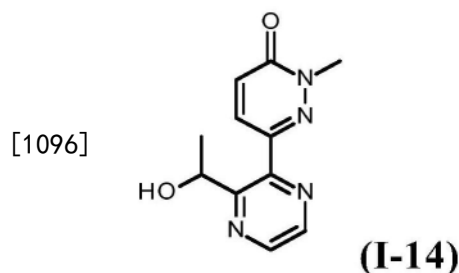
[1092] 在氩气下在热风枪干燥的RBF中将叔丁基-[1-(3-碘代吡嗪-2-基)乙氧基]-二甲基-硅烷(Int-B,如上所述制备) (1.20g,3.29mmol) 溶解在干THF (16.5mL) 中。将溶液冷却至-78℃,然后滴加turbo格氏试剂(在THF中1.3M) (3.3mL,4.28mmol)。将反应混合物在-78℃下搅拌1.5小时,然后添加氯化锌(在2-甲基四氢呋喃中1.9M) (2.3mL,4.28mmol) 并继续

搅拌3小时(得到溶液A)。在单独的容器中制备在氩气下的6-溴-2-甲基-哒嗪-3-酮(CAS 1123169-25-4)(762mg, 3.95mmol)、三(2-呋喃基)膦(96.6mg, 0.395mmol)和三(二亚苄基丙酮)二钯(0)(187mg, 0.198mmol)在干THF(16.5mL)中的溶液并在0℃下添加至溶液A中。将反应混合物在60℃下加热1小时。冷却至室温后,将混合物用氯化铵和乙酸乙酯的饱和水溶液稀释。分离相,将水层用乙酸乙酯(3×)萃取,并且将合并的有机层用盐水洗涤、经硫酸钠干燥、过滤并在减压下浓缩。将残余物通过combiflash(环己烷中的乙酸乙酯)纯化以提供呈胶状物的6-[3-[1-[叔丁基(二甲基)甲硅烷基]氧基乙基]吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮。

[1093] LCMS(方法3):保留时间1.05min,  $m/z$  347  $[M+H]^+$ 。

[1094]  $^1H$  NMR (400MHz, MeOD)  $\delta$ ppm 8.69(d, 1H), 8.66(d, 1H), 8.11(d, 1H), 7.16(d, 1H), 5.70(q, 1H), 3.88(s, 3H), 1.67(d, 3H), 0.78(s, 9H), -0.04(s, 3H), -0.10(s, 3H)。

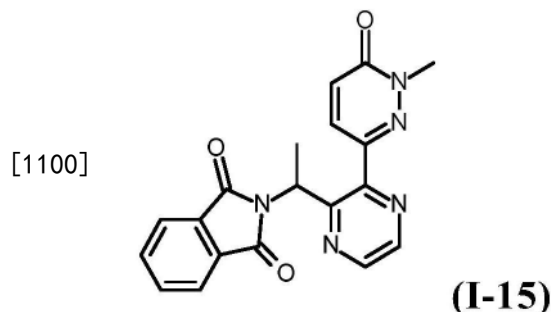
[1095] 步骤D: 6-[3-(1-羟基乙基)吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(I-14)的制备



[1097] 在0℃下在氩气下向6-[3-[1-[叔丁基(二甲基)甲硅烷基]氧基乙基]吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(I-13)(330mg, 0.629mmol)在THF(6.29mL)中的溶液中添加四丁基氟化铵(在THF中1M)(0.94mL, 0.94mmol)。将反应混合物在室温下搅拌1.5小时,然后用盐水和乙酸乙酯稀释。分离相并且将水层用乙酸乙酯萃取两次。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(环己烷中的乙酸乙酯)纯化以提供呈油状物的6-[3-(1-羟基乙基)吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮。LCMS(方法3):保留时间0.47min,  $m/z$  233  $[M+H]^+$ 。

[1098]  $^1H$  NMR (400MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$ ppm 8.54-8.68(m, 2H), 8.18(d, 1H), 7.10(d, 1H), 5.54(q, 1H), 3.93(s, 3H), 1.59(d, 3H)。

[1099] 步骤E: 2-[1-[3-(1-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基)吡嗪-2-基]乙基]异吲哚啉-1,3-二酮(I-15)的制备

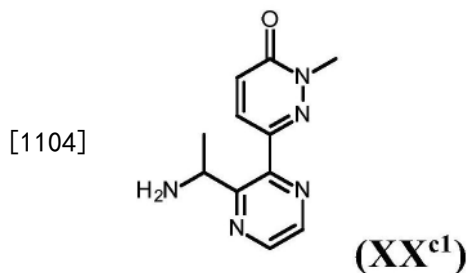


[1101] 向在氩气下在0℃下的6-[3-(1-羟基乙基)吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮(I-14)(150mg, 0.646mmol)、邻苯二甲酰亚胺(105.6mg, 0.71mmol)和三苯基膦(205.3mg, 0.78mmol)在THF(1.94mL)中的溶液中添加偶氮二甲酸二异丙酯(0.162mL, 0.7751mmol)。使反应混合物在搅拌下在1小时内温热至室温,然后用水和乙酸乙酯稀释。分离相并用乙酸乙

酯萃取水层。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 (环己烷中的乙酸乙酯) 纯化以提供呈白色泡沫的 2-[1-[3-(1-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基)吡嗪-2-基]乙基]异吡啶-1,3-二酮。LCMS (方法3): 保留时间 0.81min,  $m/z$  362  $[M+H]^+$ 。

[1102]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm 8.61 (d, 1H), 8.55 (d, 1H), 7.84 (d, 1H), 7.79-7.73 (m, 2H), 7.72-7.67 (m, 2H), 6.89 (d, 1H), 6.35 (q, 1H), 3.85 (s, 3H), 1.94 (d, 3H)。

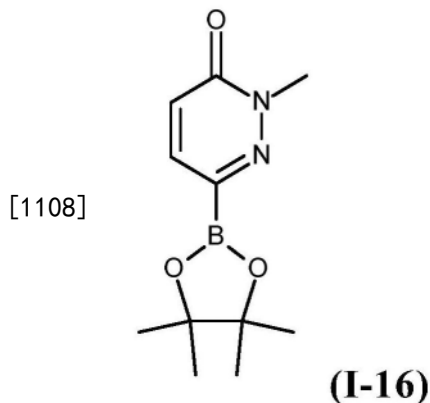
[1103] 步骤F: 6-[3-(1-氨基乙基)吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮 (化合物  $\text{XX}^{\text{c1}}$ ) 的制备



[1105] 在室温下向 2-[1-[3-(1-甲基-6-氧代-哒嗪-3-基)吡嗪-2-基]乙基]异吡啶-1,3-二酮 (I-15) (220mg, 0.61mmol) 在乙醇 (6.09mL) 中的悬浮液中添加水合肼 (0.0354mL, 0.73mmol)。将反应混合物在 80°C 下搅拌过夜, 然后冷却至室温。添加几 mL 的 TBME 并继续搅拌 20 分钟。过滤白色悬浮液, 并且在减压下蒸发滤液并干燥以提供粗 6-[3-(1-氨基乙基)吡嗪-2-基]-2-甲基-哒嗪-3-酮。

[1106] LCMS (方法3): 保留时间 0.15min,  $m/z$  232  $[M+H]^+$ 。

[1107] 实例 PI-7: 2-甲基-6-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷-2-基)哒嗪-3-酮 (I-16) 的制备



[1109] 向 6-氯-2-甲基-哒嗪-3-酮 (I-4) (500mg, 3.4588mmol) 在 1,4-二噁烷 (15mL/g) 中的搅拌的溶液中添加 4,4,5,5-四甲基-2-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷-2-基)-1,3,2-二氧杂环戊硼烷 (1.2equiv., 4.15mmol)、乙酸钾 (10.37mmol)、XPhos (0.55mmol) 和乙酸钯 (II) (0.38mmol)。将反应混合物用氮气脱气并然后将其在 100°C 下加热 3h。使反应混合物冷却至室温。通过 LCMS 监测反应进程。然后将反应混合物通过硅藻土床过滤。向滤液中添加水, 随后用 EtOAc 萃取。将有机层用盐水洗涤, 经硫酸钠干燥, 过滤并浓缩以得到呈棕色粘稠油状物的所需化合物 2-甲基-6-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷-2-基)哒嗪-3-酮 (400mg), 取其用于下一步。

[1110]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ ppm 0.04 (s, 1H), 1.15-1.28 (m, 22H), 1.33 (s, 12H), 2.01

(s, 1H), 3.67 (s, 10H), 3.85 (s, 3H), 6.87 (d, J=9.51Hz, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.50 (d, J=9.38Hz, 1H)。

[1111] 用于合成方案和制备实例的缩写

[1112] ACN 乙腈

[1113] CPME 环戊基甲基醚(或甲氧基环戊烷)

[1114] Boc 叔丁氧基羰基

[1115] DBU 1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯

[1116] DCM 二氯甲烷

[1117] DDQ 2,3-二氯-5,6-二氰基-1,4-苯醌

[1118] DMF 二甲基甲酰胺

[1119] DMSO 二甲基亚砷

[1120] DMSO-d<sub>6</sub> 氘化的二甲基亚砷

[1121] DPEN 二苯基乙二胺

[1122] Et<sub>3</sub>N 三乙胺

[1123] EtOAc 乙酸乙酯

[1124] EtOH 乙醇

[1125] HCl 盐酸

[1126] MeCN 乙腈

[1127] MeOH 甲醇

[1128] Ms 甲烷磺酰基(甲磺酰基)

[1129] n-Bu 正丁基

[1130] n-BuLi 正丁基锂

[1131] NaHCO<sub>3</sub> 碳酸氢钠

[1132] NHC N-杂环卡宾

[1133] NPhth 邻苯二甲酰亚胺-1-基

OMs 甲磺酸酯基团

[1134] OTf 三氟甲磺酸酯基团

[1135] OTs 甲苯磺酸酯基团

[1136] PdCl<sub>2</sub>dppf 1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁]钯(II)二氯化物

[1137] TBME 叔丁基甲醚

[1138] TEA 三乙胺

[1139] TEMPO (2,2,6,6-四甲基哌啶-1-基)氧氮自由基

Tf 三氟甲烷磺酰基(三氟甲磺酰基)

TFA 三氟乙酸

[1140] THF 四氢呋喃

[1141] Ts 对甲苯磺酰基(甲苯磺酰基)

[1142] XPhos 2-二环己基膦基-2',4',6'-三异丙基二苯基

[1143] aq. 水性

[1144] °C 摄氏度

|        |            |          |
|--------|------------|----------|
| [1145] | equiv.     | 当量       |
| [1146] | h          | 小时       |
| [1147] | LC/MS或LCMS | 液相色谱法质谱法 |
| [1148] | M          | 摩尔       |
| [1149] | MHz        | 兆赫       |
| [1150] | min        | 分钟       |
| [1151] | mp或M.P.    | 熔点       |
| [1152] | NMR        | 核磁共振     |
| [1153] | ppm        | 百万分率     |
| [1154] | RT         | 室温       |
| [1155] | Rt         | 保留时间     |
| [1156] | RBF        | 圆底烧瓶     |
| [1157] | TLC        | 薄层色谱法    |
| [1158] | 生物学实例      |          |

[1159] 接下来的实例用来说明本发明。本发明的某些化合物与已知的化合物的区别可以在于在低施用率下更大的功效,这可以由本领域技术人员使用在实例中概述的实验程序,使用更低的施用率(如果必要的话)例如,50ppm、24ppm、12.5ppm、6ppm、3ppm、1.5ppm、0.8ppm或0.2ppm来证实。

[1160] 实例B1:对抗二化螟(Chilo suppressalis)(水稻二化螟(Striped rice stemborer))的活性

[1161] 将具有人工饲料的24孔微量滴定板用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液通过移液进行处理。在干燥之后,用L2期幼虫对板进行侵染(6-8只/孔)。侵染之后6天,相比于未处理样品,针对死亡率、拒食效果、以及生长抑制对这些样品进行评估。当这些类别(死亡率、拒食效果、和生长抑制)中的至少一个高于未处理的样品时,实现测试样品对二化螟的控制。

[1162] 以下化合物在200ppm的施用比率下产生三个类别(死亡率、拒食作用或生长抑制)中至少一个的至少80%控制:P1、P2、P3、P4、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P15、P16、P17、P19、P21、P22、P23、P24、P25、P26、P27。

[1163] 实例B2:对抗黄瓜条叶甲(玉米根虫)的活性

[1164] 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)。侵染之后4天,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。

[1165] 以下化合物在200ppm施用比率下给出了两个类别(死亡率或生长抑制)中至少一个的至少80%控制的效果:P2、P3、P4、P6、P7、P8、P9、P10、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P19、P21、P22、P23、P24、P25、P26、P27。

[1166] 实例B3:对抗英雄美洲蟪(Euschistus heros)(新热带褐臭蟪)的活性

[1167] 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。侵染之后5天,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。

[1168] 以下化合物在200ppm施用比率下给出了两个类别(死亡率或生长抑制)中至少一个的至少80%的效果:P1、P2、P3、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P19、P21、P22、P23、P24、P25、P26、P27。

[1169] 实例B4:对抗西花蓟马(*Frankliniella occidentalis*) (西方花蓟马(*Western flower thrips*)))的活性。摄食/接触活性

[1170] 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。侵染之后7天,针对死亡率对这些样品进行评估。

[1171] 以下化合物在200ppm施用比率下产生至少80%的死亡率:P5。

[1172] 实例B5:对抗桃蚜(绿色桃蚜虫)的活性。摄食/接触活性

[1173] 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。侵染之后6天,针对死亡率对这些样品进行评估。

[1174] 以下化合物在200ppm施用比率下产生至少80%的死亡率:P2、P3、P4、P6、P7、P8、P9、P10、P12、P13、P14、P15、P17、P19、P20、P21、P22、P24、P27。

[1175] 实例B6:对抗桃蚜(绿色桃蚜虫)的活性。内在活性

[1176] 将从10'000ppm DMSO储备溶液制备的测试化合物通过移液管施用到24孔微量滴定板中并与蔗糖溶液混合。用拉伸的石蜡膜(Parafilm)封闭板。将具有24个孔的塑料模板置于板上,并将侵染的豌豆幼苗直接置于石蜡膜上。用凝胶印迹纸和另一塑料模板封闭受侵染的板,并且然后倒置。侵染之后5天,针对死亡率对这些样品进行评估。

[1177] 以下化合物在12ppm测试比率下产生至少80%的死亡率:P3、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P19、P21、P22、P23、P24、P25、P26、P27。

[1178] 实例B7:对抗小菜蛾(*Plutella xylostella*) (小菜蛾(*Diamond back moth*)))的活性

[1179] 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。侵染之后8天,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。

[1180] 以下化合物在200ppm施用比率下给出了两个类别(死亡率或生长抑制)中至少一个的至少80%控制的效果:P1、P2、P3、P4、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P18、P19、P20、P21、P22、P23、P24、P25、P26、P27。

[1181] 实例B8:对抗海灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis*) (埃及棉叶虫)的活性

[1182] 将棉花叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并用从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,针对死亡率、拒食效果、以及生长抑制对这些样品进行评估。当类别(死亡率、拒食效果、以及生长抑制)中至少一个高于未处理样品时,测试样品对海灰翅夜蛾给出了控制。

[1183] 以下化合物在200ppm的施用比率下产生三个类别(死亡率、拒食作用或生长抑制)中至少一个的至少80%控制:P2、P3、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、

P19、P21、P22、P23、P24、P25、P26、P27。

[1184] 实例B9:对抗二点叶螨(二斑叶螨)的活性。摄食/接触活性

[1185] 将24孔微量滴定板中的琼脂上的大豆叶圆片用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。干燥之后,将叶圆片用混合年龄的螨种群进行侵染。在侵染之后8天,针对混合种群(活动阶段)的死亡率对这些样品进行评估。

[1186] 以下化合物在200ppm施用比率下产生至少80%的死亡率:P6、P27。