



## (12)发明专利申请

(10)申请公布号 CN 110536886 A

(43)申请公布日 2019.12.03

(21)申请号 201880016739.8

(22)申请日 2018.03.22

(30)优先权数据

17162226.9 2017.03.22 EP

(85)PCT国际申请进入国家阶段日

2019.09.09

(86)PCT国际申请的申请数据

PCT/EP2018/057333 2018.03.22

(87)PCT国际申请的公布数据

W02018/172471 EN 2018.09.27

(71)申请人 先正达参股股份有限公司

地址 瑞士巴塞尔

(72)发明人 J·Y·卡萨耶尔 M·艾尔卡瑟米

T·皮特纳 A·斯托勒

(74)专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商标事务所 11038

代理人 张敏

(51)Int.Cl.

C07D 261/04(2006.01)

C07D 413/04(2006.01)

A01N 43/80(2006.01)

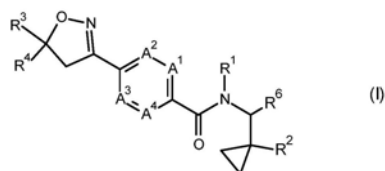
权利要求书3页 说明书88页

### (54)发明名称

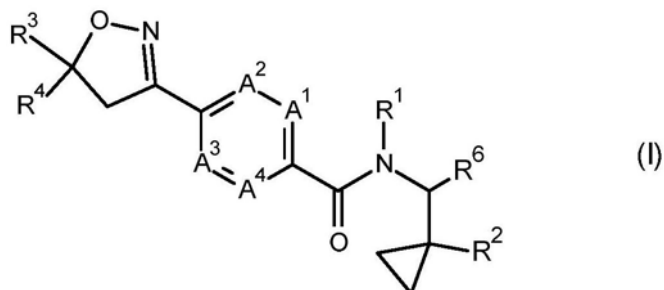
杀有害生物活性环丙基甲基酰胺衍生物

### (57)摘要

本发明涉及具有式(I)的化合物,其中取代基是如在权利要求1中所定义的,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;涉及用于制备具有式(I)的化合物的中间体,涉及包含它们的组合物并且涉及使用它们来对抗并且控制昆虫、螨、线虫和软体动物有害生物的方法。



1. 一种具有式 (I) 的化合物,



其中

$A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $A^4$ 彼此独立地是C-H、C- $R^5$ 或氮;

$R^1$ 是氢、 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 烷基羰基-、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基羰基、 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基- $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_8$ 烷基羰基氧基 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基羰基硫烷基 $C_1$ - $C_8$ 烷基氨基羰基氧基 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 二烷基氨基羰基氧基 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 烷基氨基羰基 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 二烷基氨基羰基 $C_1$ - $C_8$ 烷基或 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基羰基 $C_1$ - $C_8$ 烷基氨基 $C_1$ - $C_8$ 烷基,其中每个烷基或烷氧基基团可以任选地被从一个至三个卤素原子或者被氰基基团取代;

$R^2$ 是氰基、C(S)  $NH_2$ 或C(O)  $NH_2$ ;

$R^3$ 是 $C_1$ - $C_8$ 卤代烷基;

$R^4$ 是芳基、被一个至三个 $R^7$ 取代的芳基、杂芳基或被一个至三个 $R^7$ 取代的杂芳基;

$R^5$ 独立地是卤素、氰基、硝基、 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_3$ - $C_8$ 环烷基、 $C_1$ - $C_8$ 卤代烷基、 $C_2$ - $C_8$ 烯基、 $C_2$ - $C_8$ 卤代烯基、 $C_2$ - $C_8$ 炔基、 $C_2$ - $C_8$ 卤代炔基、 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_8$ 卤代烷氧基、或 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基羰基-,或者在相邻碳原子上的两个 $R^5$ 一起形成-CH=CH-CH=CH-桥、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-桥、-CH(OH)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-桥、-C(O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-桥或-N=CH-CH=CH-桥;

$R^6$ 是氢或 $C_1$ - $C_8$ 烷基;并且

$R^7$ 独立地是卤素、氰基、硝基、 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_8$ 卤代烷氧基;

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。

2. 根据权利要求1所述的具有式 (I) 的化合物,其中 $R^1$ 是氢、 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 烷基羰基-或 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基羰基。

3. 根据权利要求1所述的具有式 (I) 的化合物,其中 $R^1$ 是 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 烷基羰基-、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基羰基、 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基- $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_8$ 烷基羰基氧基 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基羰基硫烷基 $C_1$ - $C_8$ 烷基氨基羰基氧基 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 二烷基氨基羰基氧基 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 烷基氨基羰基 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 二烷基氨基羰基 $C_1$ - $C_8$ 烷基或 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基羰基 $C_1$ - $C_8$ 烷基氨基 $C_1$ - $C_8$ 烷基,其中每个烷基或烷氧基基团可以任选地被从一个至三个卤素原子取代基取代。

4. 根据权利要求3所述的具有式 (I) 的化合物,其中 $R^1$ 是 $C_1$ - $C_8$ 氰基烷基、 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基- $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基羰基或 $C_1$ - $C_8$ 烷基羰基氧基 $C_1$ - $C_8$ 烷基。

5. 根据权利要求4所述的具有式 (I) 的化合物,其中 $R^1$ 是甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、甲基羰基氧基甲基、1-甲基乙基羰基氧基甲基或1,1-二甲基乙基羰基

氧基甲基。

6. 根据权利要求1至5中任一项所述的具有式 (I) 的化合物, 其中 $R^2$ 是氰基。

7. 根据权利要求1至5中任一项所述的具有式 (I) 的化合物, 其中 $R^2$ 是C (S)  $NH_2$ 或C (O)  $NH_2$ 。

8. 根据权利要求1至7中任一项所述的具有式 (I) 的化合物, 其中 $R^3$ 是 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基。

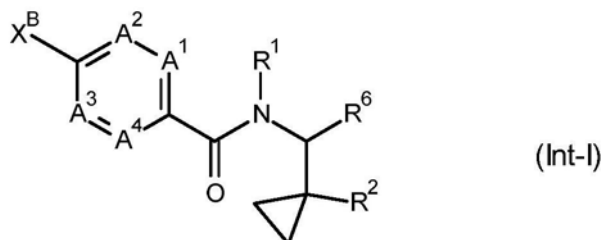
9. 根据权利要求1至8中任一项所述的具有式 (I) 的化合物, 其中 $R^4$ 是芳基、被一个至三个 $R^7$ 取代的芳基、5元-6元杂芳基或被一个至三个 $R^7$ 取代的5元-6元杂芳基。

10. 根据权利要求1至9中任一项所述的具有式 (I) 的化合物, 其中 $R^5$ 独立地是卤素、氰基、硝基、 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_3$ - $C_8$ 环烷基、 $C_1$ - $C_8$ 卤代烷基、或 $C_2$ - $C_8$ 烯基。

11. 根据权利要求1至10中任一项所述的具有式 (I) 的化合物, 其中 $R^7$ 独立地是卤素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基或 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷氧基。

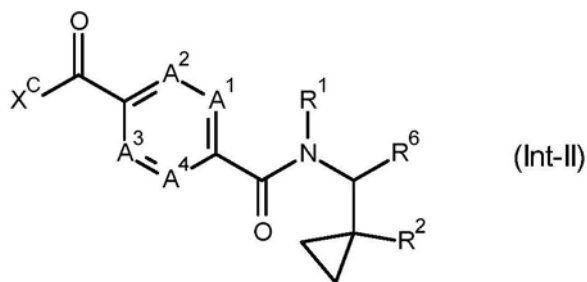
12. 根据权利要求1至11中任一项所述的具有式 (I) 的化合物, 其中 $R^6$ 是氢。

13. 一种具有式 (Int-I) 的化合物,



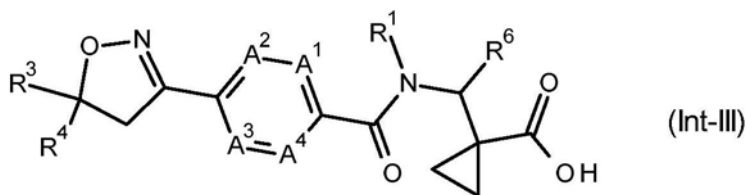
其中 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $R^1$ 和 $R^6$ 是如在权利要求1中的式 (I) 下所定义的, 并且 $X^B$ 是卤素、氰基、甲酰基、 $CH=N-OH$ 或乙酰基;  $R^2$ 是氰基、C (S)  $NH_2$ 、C (O)  $OH$ 或C (O)  $NH_2$ ; 以及具有式 (Int-I) 的化合物的盐或N-氧化物。

14. 一种具有式 (Int-II) 的化合物,



其中 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $R^1$ 和 $R^6$ 是如在权利要求1中的式 (I) 下所定义的;  $R^2$ 是氰基、C (S)  $NH_2$ 、C (O)  $OH$ 或C (O)  $NH_2$ ;  $X^C$ 是 $CH_2$ -卤素、 $CH=C (R^3) R^4$ 或 $CH_2C (OH) (R^3) R^4$ , 其中 $R^3$ 和 $R^4$ 是如在权利要求1中式 (I) 下所定义的; 以及具有式 (Int-II) 的化合物的盐或N-氧化物。

15. 一种具有式 (Int-III) 的化合物,



其中 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 和 $R^6$ 是如对于具有式 (I) 的化合物所定义的; 以及具有式 (Int-III) 的化合物的盐或N-氧化物。

16. 一种杀有害生物组合物, 该杀有害生物组合物包含至少一种根据权利要求1至12中任一项所述的具有式(I)的化合物或适当时其互变异构体作为活性成分以及至少一种助剂, 该化合物在所有情况下为游离形式或农用化学上可用的盐形式。

17. 一种用于控制有害生物的方法, 该方法包括将根据权利要求16所述的组合物施用于这些有害生物或其环境中, 除了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之外。

18. 一种用于保护种子免受有害生物攻击的方法, 该方法包括用根据权利要求16所述的组合物处理这些种子或这些种子所种植的场所。

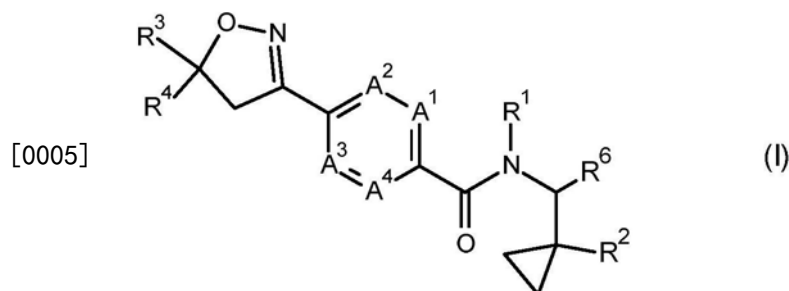
## 杀有害生物活性环丙基甲基酰胺衍生物

[0001] 本发明涉及杀有害生物活性(特别是杀昆虫活性)环丙基甲基酰胺异噁唑啉,涉及包含那些化合物的组合物,并且涉及它们用于控制动物有害生物(包括节肢动物并且特别是昆虫或蜱螨目的代表)的用途。

[0002] 具有杀昆虫特性的某些异噁唑啉衍生物披露于例如WO 2011/067272中。

[0003] 现在已经发现新颖的杀有害生物活性环丙基甲基酰胺异噁唑啉衍生物。

[0004] 本发明因此涉及具有式(I)的化合物,



[0006] 其中

[0007]  $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $A^4$ 彼此独立地是C-H、C- $R^5$ 或氮;

[0008]  $R^1$ 是氢、 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 烷基羰基-、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基羰基-、 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基- $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基羰基-、 $C_1$ - $C_8$ 烷基羰基氧基 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基羰基硫烷基 $C_1$ - $C_8$ 烷基氨基羰基氧基 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 二烷基氨基羰基氧基 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 烷基氨基羰基 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 二烷基氨基羰基 $C_1$ - $C_8$ 烷基或 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基羰基 $C_1$ - $C_8$ 烷基氨基 $C_1$ - $C_8$ 烷基,其中每个烷基或烷氧基基团可以任选地被从一个至三个卤素原子或者被氰基基团取代;

[0009]  $R^2$ 是氰基、C(S)  $NH_2$ 或C(O)  $NH_2$ ;

[0010]  $R^3$ 是 $C_1$ - $C_8$ 卤代烷基;

[0011]  $R^4$ 是芳基、被一个至三个 $R^7$ 取代的芳基、杂芳基或被一个至三个 $R^7$ 取代的杂芳基;

[0012]  $R^5$ 独立地是卤素、氰基、硝基、 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_3$ - $C_8$ 环烷基、 $C_1$ - $C_8$ 卤代烷基、 $C_2$ - $C_8$ 烯基、 $C_2$ - $C_8$ 卤代烯基、 $C_2$ - $C_8$ 炔基、 $C_2$ - $C_8$ 卤代炔基、 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_8$ 卤代烷氧基、或 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基羰基-,或者在相邻碳原子上的两个 $R^5$ 一起形成-CH=CH-CH=CH-桥、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-桥、-CH(OH)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-桥、-C(O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-桥或-N=CH-CH=CH-桥;

[0013]  $R^6$ 是氢或 $C_1$ - $C_8$ 烷基;并且

[0014]  $R^7$ 独立地是卤素、氰基、硝基、 $C_1$ - $C_8$ 烷基、 $C_1$ - $C_8$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_8$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_8$ 卤代烷氧基;

[0015] 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。

[0016] 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酸形成例如酸加成盐:与强无机酸,如矿物酸,例如高氯酸、硫酸、硝酸、磷酸或氢卤酸;与强有机羧酸,如未经取代的或例如被卤素取代的 $C_1$ - $C_4$ 烷羧酸,例如乙酸(如饱和或不饱和的二羧酸)、例如草酸、丙二酸、琥珀酸、马来酸、富马酸或邻苯二甲酸(如羟基羧酸)、例如抗坏血酸、乳酸、苹果酸、酒石酸或柠檬酸、或如苯甲酸;或者与有机磺酸,如未经取代的或例如被卤素取代的 $C_1$ - $C_4$

烷-或芳基磺酸,例如甲烷-或对甲苯磺酸。具有至少一个酸性基团的具有式(I)的化合物可以例如与碱形成盐,例如矿物盐,例如碱金属或碱土金属盐,例如钠盐、钾盐或镁盐;或与氨或有机胺形成盐,例如吗啉、哌啶、吡咯烷、单、二或三低碳数烷基胺,例如乙胺、二乙胺、三乙胺或二甲基丙基胺,或单、二或三羟基低碳数烷基胺,例如单乙醇胺、二乙醇胺或三乙醇胺。

[0017] 在取代基定义中出现的烷基基团可以是直链的或支链的,并且是但不限于甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、戊基、己基、壬基、癸基以及它们的支链异构体。烷基硫烷基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基羰基、烷氧基、烯基和炔基基团衍生自所提及的烷基基团。烯基和炔基基团可以是单不饱和的或多不饱和的。

[0018] 卤素通常是氟、氯、溴或碘。相应地,这也适用于与其他含义结合的卤素,例如卤代烷基或卤代苯基。

[0019] 卤代烷基基团优选地具有从1至6个碳原子的链长。卤代烷基是但不限于氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、2,2,2-三氟乙基、2-氟乙基、2-氯乙基、五氟乙基、1,1-二氟-2,2,2-三氯乙基、2,2,3,3-四氟乙基以及2,2,2-三氯乙基。

[0020] 烷氧基的实例包括但不限于甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基和叔丁氧基以及同分异构的戊氧基和己氧基基团。

[0021] 烷氧基烷基基团优选地具有1个至6个碳原子的链长。烷氧基烷基的实例包括但不限于甲氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基甲基、乙氧基乙基、正丙氧基甲基、正丙氧基乙基、异丙氧基甲基或异丙氧基乙基。

[0022] 烷氧基羰基的实例包括但不限于甲氧基羰基(其为C<sub>1</sub>烷氧基羰基)、乙氧基羰基、丙氧基羰基、异丙氧基羰基、正丁氧基羰基、叔丁氧基羰基、正戊氧基羰基或己氧基羰基。

[0023] 这些环烷基基团优选地具有从3个至6个环碳原子,并且是例如环丙基、环丁基、环戊基和环己基。

[0024] 如在此使用的,术语“C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>炔基”是指仅由碳原子和氢原子组成的直链或支链的烃链基团,该烃链基团含有至少一个三键,具有从二个至八个碳原子,并且其通过单键附接至该分子的剩余部分。C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>炔基的实例包括但不限于乙炔基、丙-1-炔基、丁-1-炔基、和丁-2-炔基。

[0025] 如在此使用的,术语“C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯基”是指仅由碳原子和氢原子组成的直链或支链的烃链基团,该烃链基团含有至少一个双键,具有从二个至八个碳原子,并且其通过单键附接至该分子的剩余部分。C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯基的实例包括但不限于丙-1-烯基、丁-1-烯基、和丁-2-烯基。

[0026] 如在此使用的,烷基羰基氧基烷基是指基团-ROC(O)R,其中每个R独立地是C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基。

[0027] 如在此使用的,烷基氨基羰基氧基烷基是指基团-ROC(O)NHR,其中每个R独立地是C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基。

[0028] 如在此使用的,二烷基氨基羰基氧基烷基是指基团-ROC(O)NRR,其中每个R独立地是C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基。

[0029] 如在此使用的,烷基氨基羰基烷基是指基团-RC(O)NHR,其中每个R独立地是C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基。

[0030] 如在此使用的,二烷基氨基羰基烷基是指基团-RC(O)NRR,其中每个R独立地是C<sub>1</sub>-

C<sub>8</sub>烷基。

[0031] 如在此使用的,烷氧基羰基硫烷基是指基团-SC(O)OR,其中R是C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基。

[0032] 如在此使用的,烷氧基羰基烷基氨基烷基是指基团-RNH(R)C(O)OR,其中每个R独立地是C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基。

[0033] 根据本发明的具有式(I)的化合物还包括在盐形成期间可以形成的水合物。

[0034] A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、A<sup>4</sup>、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>和R<sup>7</sup>的优选值以其任何组合是如以下列出的。

[0035] 优选地,A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>和A<sup>4</sup>中至少两个不为氮。

[0036] 优选地,A<sup>1</sup>是C-H或C-R<sup>5</sup>;更优选地,A<sup>1</sup>是C-R<sup>5</sup>。

[0037] 优选地,A<sup>2</sup>是C-H或C-R<sup>5</sup>;更优选地,A<sup>2</sup>是C-H。

[0038] 优选地,A<sup>3</sup>是C-H或N;更优选地,A<sup>3</sup>是C-H。

[0039] 优选地,A<sup>4</sup>是C-H或N;更优选地,A<sup>4</sup>是C-H。

[0040] 在优选的实施例中,A<sup>1</sup>是N、C-H或C-R<sup>5</sup>,A<sup>2</sup>是C-H,A<sup>3</sup>是C-H或N,并且A<sup>4</sup>是C-H。

[0041] 在本发明的优选的实施例中,R<sup>1</sup>是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基羰基-或C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基羰基;R<sup>2</sup>是氰基、C(S)NH<sub>2</sub>或C(O)NH<sub>2</sub>;R<sup>3</sup>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基;R<sup>4</sup>是芳基、被一个至三个R<sup>7</sup>取代的芳基、5元-6元杂芳基或被一个至三个R<sup>7</sup>取代的5元-6元杂芳基;R<sup>5</sup>独立地是卤素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>卤代烷基、或C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯基;R<sup>7</sup>独立地是卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基。

[0042] 在更优选的实施例中,R<sup>1</sup>是氢、甲基、乙基、甲基羰基-、或甲氧基羰基;R<sup>2</sup>是氰基、C(S)NH<sub>2</sub>或C(O)NH<sub>2</sub>;R<sup>3</sup>是氯二氟甲基或三氟甲基;R<sup>4</sup>是芳基或被一个至三个R<sup>7</sup>取代的芳基;R<sup>5</sup>独立地是卤素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、或C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>卤代烷基;R<sup>7</sup>独立地是甲基、氟、氯、溴、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或甲氧基。

[0043] 在甚至更优选的实施例中,R<sup>1</sup>是氢、甲基或乙基;尤其是氢或甲基;更尤其是氢。R<sup>2</sup>是氰基、C(S)NH<sub>2</sub>或C(O)NH<sub>2</sub>;R<sup>3</sup>是三氟甲基;R<sup>4</sup>是苯基或被一个至三个R<sup>7</sup>取代的苯基;甚至更优选地,R<sup>4</sup>是被一个至三个R<sup>7</sup>取代的苯基;R<sup>5</sup>独立地是溴、氯、氟、氰基、硝基、甲基、乙基、三氟甲基、环丙基、或乙烯基;R<sup>7</sup>独立地是Cl、Br、F、CF<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>或OCH<sub>3</sub>。

[0044] 在最优选的实施例中,R<sup>1</sup>尤其是氢或甲基;优选地是氢。R<sup>2</sup>是氰基、C(S)NH<sub>2</sub>或C(O)NH<sub>2</sub>;R<sup>3</sup>是三氟甲基;R<sup>4</sup>是3,5-双-(三氟甲基)-苯基、3-氯-5-三氟甲基-苯基、3-溴-5-三氟甲基-苯基、3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,4-二氯-苯基、3-三氟甲基-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,5-二氯-4-氟-苯基或3,4,5-三氯-苯基;优选地,R<sup>4</sup>是3-氯-5-三氟甲基-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、3,5-二氯-4-氟-苯基、或3,4,5-三氯-苯基;R<sup>5</sup>独立地是溴、氯、氟、环丙基、三氟甲基、乙烯基、或甲基;优选地是氯、溴、环丙基、或甲基。

[0045] 在本发明的另一个实施例中,R<sup>1</sup>是C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基羰基-、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基羰基氧基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基羰基硫烷基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基氨基羰基氧基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>二烷基氨基羰基氧基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基氨基羰基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>二烷基氨基羰基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基或C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基羰基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基氨基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基,其中每个烷基或烷氧基基团可以任选地被从一个至三个卤素原子或者被氰基基团取代;R<sup>2</sup>是氰基、C(S)NH<sub>2</sub>或C(O)NH<sub>2</sub>;R<sup>3</sup>是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基;R<sup>4</sup>是芳基、被一个至三个R<sup>7</sup>取代的芳基、5元-6元杂芳基或被一个至三个R<sup>7</sup>取代的5元-6元杂芳基;R<sup>5</sup>独立地是卤素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>卤代烷基、或C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯基;R<sup>7</sup>独立地是卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷

基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基。

[0046] 在更优选的实施例中，R<sup>1</sup>是C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基羰基氧基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基，其中每个烷基或烷氧基基团可以任选地被从一个至三个卤素原子或被氰基基团取代；R<sup>2</sup>是氰基、C(S)NH<sub>2</sub>或C(O)NH<sub>2</sub>；R<sup>3</sup>是氯二氟甲基或三氟甲基；R<sup>4</sup>是芳基或被一个至三个R<sup>7</sup>取代的芳基；R<sup>5</sup>独立地是卤素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、或C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>卤代烷基；R<sup>7</sup>独立地是甲基、氟、氯、溴、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或甲氧基。

[0047] 在甚至更优选的实施例中，R<sup>1</sup>是C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>氰基烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基羰基或C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基羰基氧基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基；R<sup>2</sup>是氰基、C(S)NH<sub>2</sub>或C(O)NH<sub>2</sub>；R<sup>3</sup>是三氟甲基；R<sup>4</sup>是苯基或被一个至三个R<sup>7</sup>取代的苯基；甚至更优选地，R<sup>4</sup>是被一个至三个R<sup>7</sup>取代的苯基；R<sup>5</sup>独立地是溴、氯、氟、氰基、硝基、甲基、乙基、三氟甲基、环丙基、或乙烯基；R<sup>7</sup>独立地是Cl、Br、F、CF<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>或OCH<sub>3</sub>。

[0048] 在最优选的实施例中，R<sup>1</sup>是甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、甲基羰基氧基甲基、1-甲基乙基羰基氧基甲基或1,1-二甲基乙基羰基氧基甲基；R<sup>2</sup>是氰基、C(S)NH<sub>2</sub>或C(O)NH<sub>2</sub>；R<sup>3</sup>是三氟甲基；R<sup>4</sup>是3,5-双-(三氟甲基)-苯基、3-氯-5-三氟甲基-苯基、3-溴-5-三氟甲基-苯基、3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,4-二氯-苯基、3-三氟甲基-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,5-二氯-4-氟-苯基或3,4,5-三氯-苯基；优选地，R<sup>4</sup>是3-氯-5-三氟甲基-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、3,5-二氯-4-氟-苯基、或3,4,5-三氯-苯基；R<sup>5</sup>独立地是溴、氯、氟、环丙基、三氟甲基、乙烯基、或甲基；优选地是氯、溴、环丙基、或甲基。

[0049] 实施例E1：

[0050] 在本发明的优选的实施例中，R<sup>1</sup>是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基羰基-或C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基羰基；更优选地是氢、甲基、乙基、甲基羰基-、或甲氧基羰基；最优选地是氢、甲基或乙基；尤其是氢或甲基；更尤其是氢。

[0051] 实施例E1-1：

[0052] 在本发明的优选的实施例中，优选地，R<sup>1</sup>是C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基羰基-、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基羰基氧基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基羰基硫烷基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基氨基羰基氧基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>二烷基氨基羰基氧基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基氨基羰基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>二烷基氨基羰基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基或C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基羰基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基氨基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基，其中每个烷基或烷氧基基团可以任选地被从一个至三个卤素原子或被氰基基团取代；优选地，R<sup>1</sup>是C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>氰基烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基羰基或C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基羰基氧基C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基；并且最优选地，R<sup>1</sup>是甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、甲基羰基氧基甲基、1-甲基乙基羰基氧基甲基或1,1-二甲基乙基羰基氧基甲基。

[0053] 实施例E2：

[0054] 在本发明的优选的实施例中，优选地，R<sup>2</sup>是氰基。

[0055] 实施例E2-1：

[0056] 在本发明的优选的实施例中，优选地，R<sup>2</sup>是C(S)NH<sub>2</sub>。

[0057] 实施例E2-2：



[0058] 在本发明的优选的实施例中,优选地, $R^2$ 是C(O)NH<sub>2</sub>。

[0059] 实施例E3:

[0060] 在本发明的优选的实施例中,优选地, $R^3$ 是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基;更优选地是氯二氟甲基或三氟甲基;最优选地是三氟甲基。

[0061] 实施例E4:

[0062] 在本发明的优选的实施例中,优选地, $R^4$ 是芳基、被一个至三个 $R^7$ 取代的芳基、5元-6元杂芳基或被一个至三个 $R^7$ 取代的5元-6元杂芳基;更优选地, $R^4$ 是芳基或被一个至三个 $R^7$ 取代的芳基;最优选地是苯基或被一个至三个 $R^7$ 取代的苯基;甚至更优选地, $R^4$ 是被一个至三个 $R^7$ 取代的苯基;尤其 $R^4$ 是3,5-双-(三氟甲基)-苯基、3-氯-5-三氟甲基-苯基、3-溴-5-三氟甲基-苯基、3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,4-二氯-苯基、3-三氟甲基-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,5-二氯-4-氟-苯基或3,4,5-三氯-苯基;更尤其 $R^4$ 是3-氯-5-三氟甲基-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、3,5-二氯-4-氟-苯基、或3,4,5-三氯-苯基。

[0063] 实施例E5:

[0064] 在本发明的优选的实施例中,优选地, $R^5$ 独立地是卤素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>卤代烷基、或C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯基;更优选地是卤素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>环烷基、或C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>卤代烷基;甚至更优选地是溴、氯、氟、氰基、硝基、甲基、乙基、三氟甲基、环丙基或乙烯基;仍甚至更优选地是溴、氯、氟、环丙基、三氟甲基、乙烯基、或甲基;最优选地是氯、溴、或甲基。

[0065] 实施例E6:

[0066] 在本发明的优选的实施例中,优选地, $R^7$ 独立地是卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>卤代烷氧基;更优选地是甲基、氟、氯、溴、三氟甲基、三氟甲氧基、氰基或甲氧基;甚至更优选地, $R^7$ 是Cl、Br、F、CF<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>或OCH<sub>3</sub>。

[0067] 如以下表E所示,可以将实施例E1至E6的每一个组合成具有式(I)的化合物的新的优选的组。

[0068] 表E:式(I)的优选的实施例:

组合	组合	组合	组合	组合
<b>E1+E2</b>	<b>E3+E6</b>	<b>E1+E4+E5</b>	<b>E1+E2+E3+E6</b>	<b>E1+E2+E3+E5</b>
<b>E1+E3</b>	<b>E4+E5</b>	<b>E1+E4+E6</b>	<b>E1+E2+E4+E6</b>	<b>E1+E2+E4+E5</b>
<b>E1+E4</b>	<b>E4+E6</b>	<b>E1+E5+E6</b>	<b>E1+E2+E5+E6</b>	<b>E1+E3+E4+E5</b>
<b>E1+E5</b>	<b>E5+E6</b>	<b>E2+E3+E4</b>	<b>E1+E3+E4</b>	<b>E2+E3+E4+E5</b>

[0070]

			<b>+E6</b>	
<b>E1+E6</b>	<b>E1+E2+E3</b>	<b>E2+E3+E5</b>	<b>E1+E3+E5</b> <b>+E6</b>	<b>E1+E2+E3+E4+</b> <b>E5</b>
<b>E2+E3</b>	<b>E1+E2+E4</b>	<b>E2+E3+E6</b>	<b>E1+E4+E5</b> <b>+E6</b>	<b>E1+E2+E3+E5+</b> <b>E6</b>
<b>E2+E4</b>	<b>E1+E2+E5</b>	<b>E2+E4+E5</b>	<b>E2+E3+E5</b> <b>+E6</b>	<b>E1+E2+E3+E4+</b> <b>E5+E6</b>
<b>E2+E5</b>	<b>E1+E2+E6</b>	<b>E2+E4+E6</b>	<b>E1+E2+E3</b> <b>+E4</b>	
<b>E2+E6</b>	<b>E1+E3+E4</b>	<b>E2+E5+E6</b>	<b>E2+E3+E4</b> <b>+E6</b>	
<b>E3+E4</b>	<b>E1+E3+E5</b>	<b>E3+E4+E6</b>	<b>E2+E4+E5</b> <b>+E6</b>	
<b>E3+E5</b>	<b>E1+E3+E6</b>	<b>E3+E5+E6</b>	<b>E3+E4+E5</b> <b>+E6</b>	

[0071] 表E-1:式(I)的优选的实施例:

[0072] 如在表E中所示,可以将实施例E1至E6的每一个组合成具有式(I)的化合物的新的优选的组,但是E1具有实施例E1-1的意义。

[0073] 表E-2:式(I)的优选的实施例:

[0074] 如在表E中所示,可以将实施例E1至E6的每一个组合成具有式(I)的化合物的新的优选的组,但是E2具有实施例E2-1的意义。

[0075] 表E-3:式(I)的优选的实施例:

[0076] 如在表E中所示,可以将实施例E1至E6的每一个组合成具有式(I)的化合物的新的优选的组,但是E2具有实施例E2-2的意义。

[0077] 表E-4:式(I)的优选的实施例:

[0078] 实施例E1至E6,可以将实施例E1至E6的每一个组合成如在表E中所示的具有式(I)的化合物的新的优选的组,但是E1具有实施例E1-1的意义并且E2具有实施例E2-1的意义。

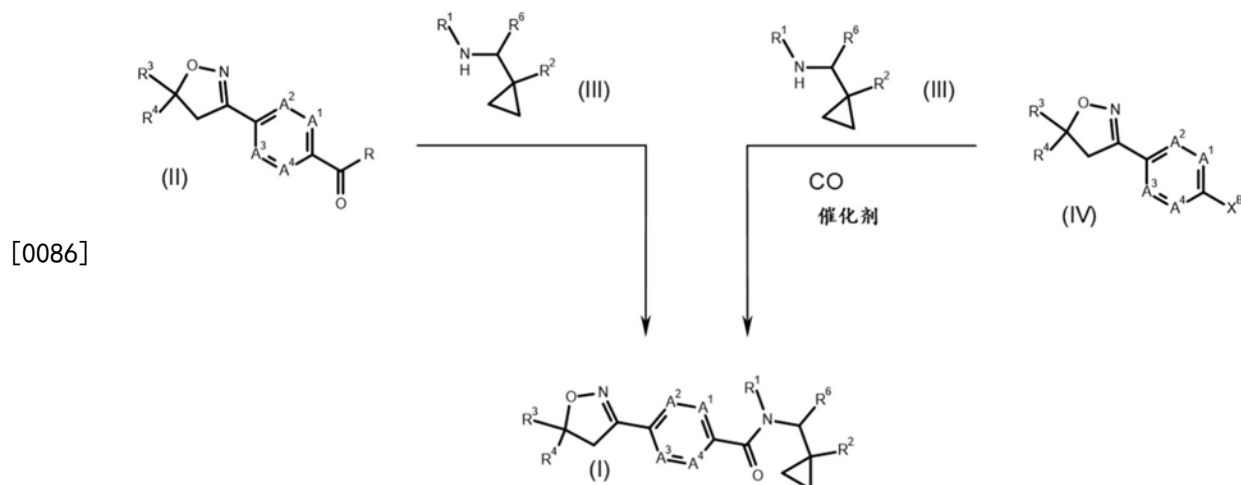
[0079] 表E-5:式(I)的优选的实施例:

[0080] 实施例E1至E6,可以将实施例E1至E6的每一个组合成如在表E中所示的具有式(I)的化合物的新的优选的组,但是E1具有实施例E1-1的意义并且E2具有实施例E2-1的意义。

[0081] 在以上提及的优选的实施例的全部以及表E的组合中, $R^6$ 优选地是氢。[0082] 在以上提及的优选的实施例的全部以及表E的组合中, $A^1$ 优选地是N、C-H或 $C-R^5$ , $A^2$ 优选地是C-H, $A^3$ 优选地是C-H或N并且 $A^4$ 优选地是C-H。[0083] 更优选地,在以上提及的优选的实施例的全部以及表E的组合中, $A^1$ 优选地是C- $CH_3$ , $A^2$ 优选地是C-H, $A^3$ 优选地是C-H并且 $A^4$ 优选地是C-H。

[0084] 本发明的这些化合物可以通过方案1至5中示出的多种方法来制造。

[0085] 方案1



[0087] 1) 如方案1中所述,具有式(I)的化合物可以通过将具有式(II)的化合物(其中R是OH、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基或Cl、F或Br)与具有式(III)的胺(其中R<sup>6</sup>是H或C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基,并且R<sup>2</sup>是氰基、C(S)NH<sub>2</sub>或C(O)NH<sub>2</sub>)进行反应来制备。当R为OH时,此类反应通常是在偶联剂(例如N,N'-二环己基碳二亚胺("DCC")、1-乙基-3-(3-二甲基氨基-丙基)碳二亚胺盐酸盐("EDC")或双(2-氧代-3-噁唑烷基)磷酰氯("BOP-Cl"))存在之下、以及可任选地在亲核性催化剂(例如羟基苯并三唑("HOBT"))的存在下进行。当R为Cl时,此类反应通常是在碱的存在下、以及可任选地在亲核性催化剂存在下进行。可替代地,有可能在包括有机溶剂(优选为乙酸乙酯)、及水性溶剂(优选为碳酸氢钠溶液)的双相系统中进行此反应。当R为C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基时,有时有可能通过在一种热过程中一起加热酯和胺而将酯直接转换成为酰胺。合适的碱包括吡啶,三乙胺,4-(二甲基氨基)-吡啶("DMAP")或二异丙基乙基胺(胡宁氏碱(Hunig's base))。优选的溶剂为N,N-二甲基乙酰胺、四氢呋喃、二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、乙酸乙酯和甲苯。该反应是在从0℃到100℃、优选地从15℃到30℃的温度下、特别是在环境温度下进行的。具有式(III)的胺是文献中已知的,或者可使用本领域普通技术人员已知的方法进行制备。

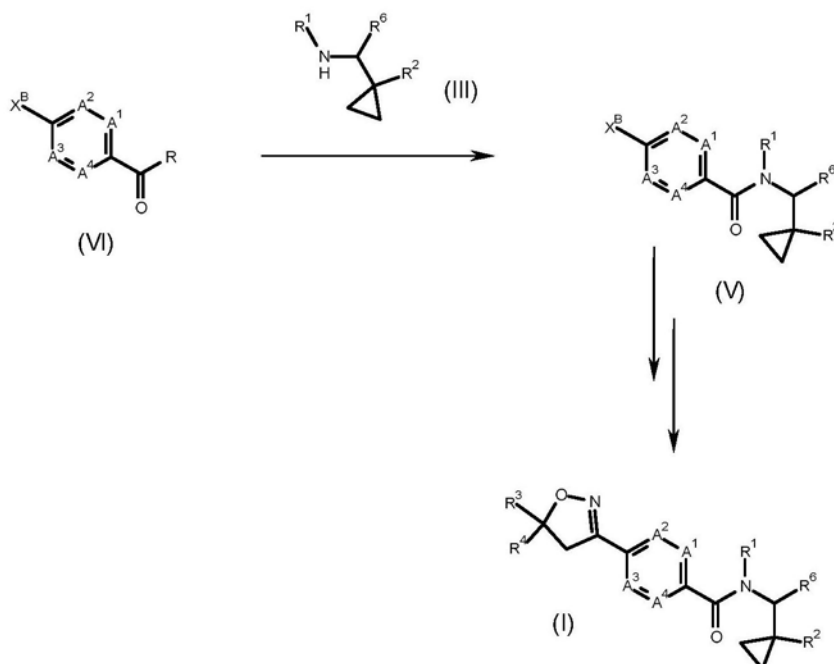
[0088] 2) 具有式(II)的酸卤化物(其中R是Cl、F或Br)可在标准条件从具有式(II)的羧酸(其中R是OH)进行制备,例如在W0 2009/080250中描述的。

[0089] 3) 具有式(II)的羧酸(其中R为OH)可从具有式(II)的酯(其中R为C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基)进行制备,例如在W0 2009/080250中所述的。

[0090] 4) 在催化剂(如乙酸钨(II)或双(三苯膦)钨(II)二氯化物)、任选地在配体(如三苯膦)、以及碱(如碳酸钠、吡啶、三乙胺、4-(二甲氨基)-吡啶("DMAP")或二异丙基乙基胺(胡宁氏碱))的存在下,在溶剂(如水、N,N-二甲基甲酰胺或四氢呋喃)中,具有式(I)的化合物可以通过将具有式(IV)的化合物(其中X<sup>B</sup>是离去基团,例如卤素(如溴))与一氧化碳和具有式(III)的胺进行反应来制备。该反应是在从50℃至200℃,优选地从100℃至150℃的温度下进行。该反应是在从50巴至200巴,优选地从100巴至150巴的压力下进行。

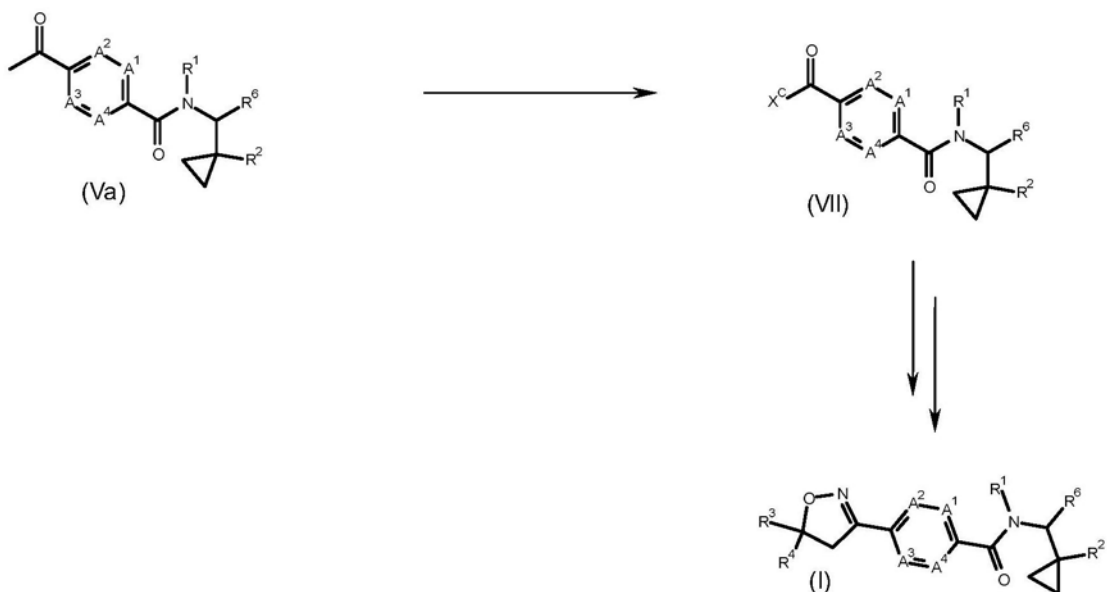
[0091] 5) 具有式(IV)的化合物(其中X<sup>B</sup>是一个离去基团,例如一种卤素,比如溴)可以通过各种方法来制造,例如在W0 2009/080250所描述的。

[0092] 方案2



[0094] 6) 可替代地,如方案2中所示,具有式(I)的化合物(其中 $R^6$ 是H或 $C_1$ - $C_8$ 烷基,并且 $R^2$ 是氰基、 $C(S)NH_2$ 或 $C(O)NH_2$ )可以通过各种方法从具有式(V)的中间体(其中 $X^B$ 是离去基团,例如卤素(如溴),或者 $X^B$ 是氰基、甲酰基或乙酰基),根据与W0 2009/080250中描述的那些相似的方法来制备。具有式(V)的中间产物例如可以从如在该相同文献中所述的具有式(VI)的中间产物制备。

[0095] 方案3



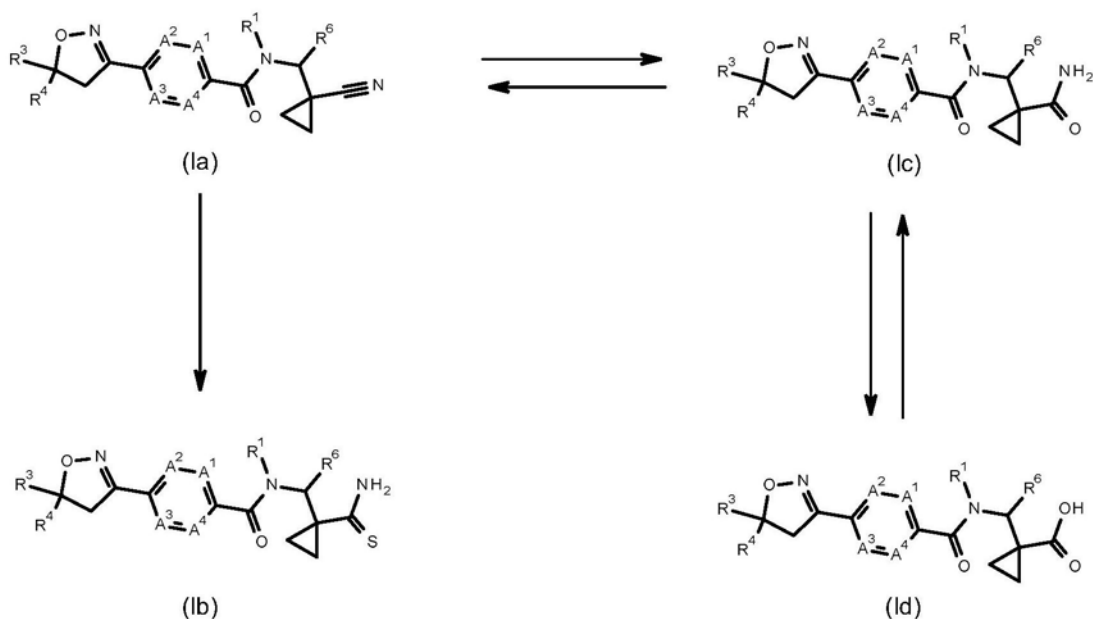
[0097] 7) 可替代地,如方案3中所示,具有式(I)的化合物可以通过各种方法从具有式(VII)的中间产物(其中 $X^C$ 是 $CH=C(R^3)R^4$ 、或 $CH_2C(OH)(R^3)R^4$ (其中 $R^3$ 和 $R^4$ 是如对于具有式(I)的化合物所定义的)),根据与W0 2009/080250中描述的那些相似的方法来制备。

[0098] 8) 具有式(VII)的化合物(其中 $X^C$ 是 $CH=C(R^3)R^4$ 、或 $CH_2C(OH)(R^3)R^4$ )可以从具有式(Va)的化合物或从具有式(VII)的化合物(其中 $X^C$ 是 $CH_2$ -卤素),使用与W0 2009/080250中描述的那些相似的方法来制备。

[0099] 9) 具有式 (VII) 的化合物 (其中 $X^C$ 是 $CH_2$ -卤素, 例如溴或氯) 可以通过在从 $0^\circ C$ 至 $50^\circ C$ , 优选地从环境温度至 $40^\circ C$ 的温度下, 在溶剂 (例如乙酸) 中使具有式 (Va) 的甲基酮与卤化剂 (例如溴或氯) 反应来制备。

[0100] 方案4

[0101]



[0102] 10) 如方案4中所示, 具有式 (Ic) 的化合物可以通过将具有式 (Ia) 的化合物进行反应来制备。此类反应通常可以使用本领域技术人员已知的方法, 在酸 (如硫酸)、或碱 (如氢氧化钠、或甚至过氧化氢) 的存在下进行。

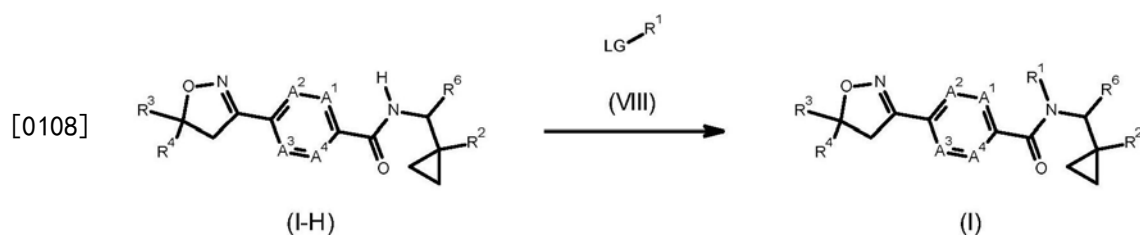
[0103] 11) 此外, 如方案4中所示, 具有式 (Ia) 的化合物可以通过将具有式 (Ic) 的化合物进行反应来制备。此类反应通常使用本领域技术人员已知的方法, 在脱水剂 (如三氟乙酸酐或氧化磷(V)) 的存在下进行。

[0104] 12) 如方案4中所示, 具有 (Ib) 的化合物可以通过将具有式 (Ia) 的化合物进行反应来制备。此类反应通常在硫化剂 (如五硫化二磷或劳氏试剂 (Lawesson's reagent) 或 $H_2S$ 或硫化铵) 的存在下, 使用本领域技术人员已知的方法进行。

[0105] 13) 如在10) 中指示, 具有式 (Id) 的化合物可以通过将具有式 (Ic) 进行反应来制备。

[0106] 14) 具有式 (Ic) 的化合物可以通过使用本领域技术人员已知的方法, 将具有式 (Id) 的化合物与氨进行反应来制备。

[0107] 方案5



[0109] 15) 如方案5中所示, 具有式 (I) 的化合物可以通过将具有式 (I-H) 的化合物与具有式 (VIII) 的化合物 (其中LG是适合的离去基团, 例如卤素 (如溴或氯)、或咪唑或烷基磺酰基

基团或卤代烷基磺酰基基团或芳基磺酰基基团)进行反应来制备。此类反应通常使用本领域技术人员已知的方法,在碱(如氢氧化钠或氰化钠)的存在下进行。

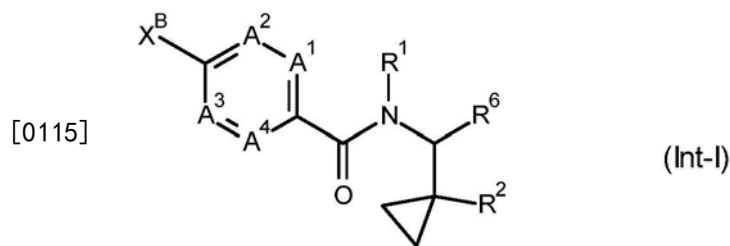
[0110] 这些反应物可以在碱的存在下进行反应。适合的碱的实例是碱金属或碱土金属氢氧化物、碱金属或碱土金属氢化物、碱金属或碱土金属酰胺、碱金属或碱土金属醇盐、碱金属或碱土金属乙酸盐、碱金属或碱土金属碳酸盐、碱金属或碱土金属二烷基酰胺或碱金属或碱土金属烷基甲硅烷基酰胺、烷基胺、亚烷基二胺、游离的或N-烷基化的饱和或不饱和的环烷基胺、碱性杂环、氢氧化铵以及碳环胺。可以提及的实例是氢氧化钠、氢化钠、氨基钠、甲醇钠、乙酸钠、碳酸钠、叔丁醇钾、氢氧化钾、碳酸钾、氢化钾、二异丙氨基锂、双(三甲基硅烷基)酰胺钾、氢化钙、三乙胺、二异丙基乙胺、三亚乙基二胺、环己胺、N-环己基-N,N-二甲胺、N,N-二乙苯胺、吡啶、4-(N,N-二甲氨基)吡啶、奎宁环、N-甲基吗啉、苄基三甲基铵氢氧化物以及1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一-7-烯(DBU)。

[0111] 这些反应物可以按照原样彼此进行反应,即:不用加入溶剂或稀释剂。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。

[0112] 该反应有利地是在从约-80°C到约+140°C,优选从约-30°C到约+100°C,在许多情况下在介于环境温度与约+80°C之间的温度下进行。

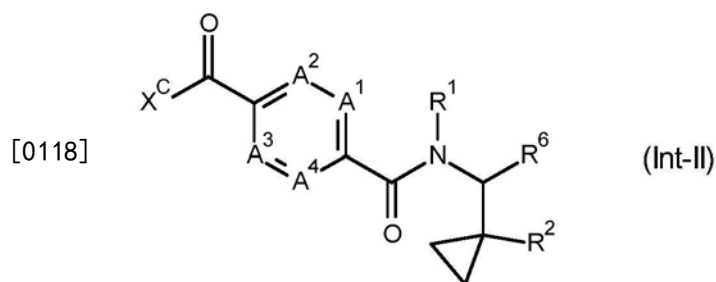
[0113] 具有式(I)的化合物能以本身已知的方法转化为另一种具有式(I)的化合物,这是通过以常规方式将具有式(I)的起始化合物的一个或多个取代基用根据本发明的另一个或其他一个或多个取代基的替代来实现的。取决于所选的适合各自情况的反应条件以及起始材料,有可能例如,在一个反应步骤中仅将一个取代基用根据本发明的另一个取代基替代,或者在同一个反应步骤中可以将多个取代基用多个根据本发明的其他取代基来替代。

[0114] 本发明还提供了用于制备具有式(I)的化合物的中间体。某些中间体是新颖的并且如此形成本发明的另一个方面。一组新颖中间体是具有式(Int-I)的化合物



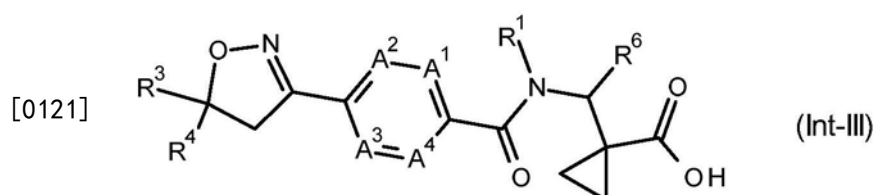
[0116] 其中A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、A<sup>4</sup>、R<sup>1</sup>和R<sup>6</sup>是如对于具有式(I)的化合物的定义,并且X<sup>B</sup>是卤素(如溴),或X<sup>B</sup>是氰基、甲酰基、CH=N-OH或乙酰基;R<sup>2</sup>是氰基、C(S)NH<sub>2</sub>、C(O)OH或C(O)NH<sub>2</sub>;及其盐或N-氧化物。对于A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、A<sup>4</sup>和R<sup>1</sup>的优选项和对于具有式(I)的化合物的对应取代基所列出的优选项是相同的。

[0117] 另一组新颖中间体是具有式(Int-II)的化合物



[0119] 其中 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $R^1$ 和 $R^6$ 是如对于具有式(I)的化合物所定义的； $R^2$ 是氰基、C(S)NH<sub>2</sub>、C(O)OH或C(O)NH<sub>2</sub>； $X^C$ 是CH<sub>2</sub>-卤素，其中卤素是例如溴或氯、CH=C(R<sup>3</sup>)R<sup>4</sup>或CH<sub>2</sub>C(OH)(R<sup>3</sup>)R<sup>4</sup>，其中R<sup>3</sup>和R<sup>4</sup>是如对于具有式(I)的化合物所定义的；及其盐或N-氧化物。对于 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $R^1$ 和 $R^6$ 的优选项和具有式(I)的化合物的对应取代基所列出的优选项是相同的。

[0120] 另一组新颖中间体是具有式(Int-III)的化合物



[0122] 其中 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 和 $R^6$ 是如对于具有式(I)的化合物所定义的；及其盐或N-氧化物。对于 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 和 $R^6$ 的优选项和具有式(I)的化合物的对应取代基所列出的优选项是相同的。

[0123] 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，在每种情况下为游离形式或为盐形式的具有式(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所有可能的异构体混合物，并且在上文和下文中都应如此理解，即使立体化学细节未在所有情况下明确提及。

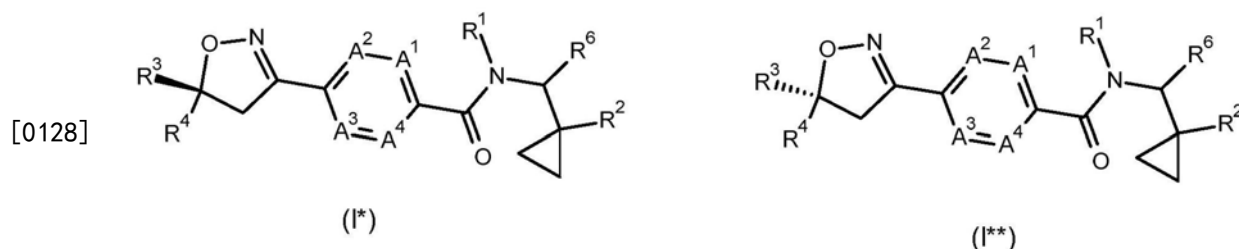
[0124] 处于游离形式或处于盐形式的具有式(I)的化合物的非对映异构体混合物或外消旋体混合物(它们的获得可以取决于已选定的起始材料和程序)能够在这些组分的物理化学差异的基础上，例如通过分步结晶、蒸馏和/或层析法以已知的方式分离成纯的非对映异构体或外消旋体。

[0125] 能够以一种类似方式获得的对映异构体混合物(例如外消旋体)可以通过已知方法拆分成光学对映体，例如通过从一种光学活性溶剂再结晶；通过在手性吸附剂上的层析法，例如在乙酰纤维素上的高效液相层析法(HPLC)；借助于合适的微生物，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盐，例如通过使一种碱性最终产物外消旋体与一种光学活性酸(例如羧酸，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，从这些非对映异构体可以通过合适的试剂(例如碱性试剂)的作用使所希望的对映异构体变成游离。

[0126] 纯的非对映异构体或对映异构体能根据本发明来获得，不仅是通过分离合适的异

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利用一种合适的立体化学的起始材料进行该方法。

[0127] 具有式 (I\*) 的化合物包括至少一个手性中心并且可以作为具有式 (I\*) 的化合物或具有式 (I\*\*) 的化合物存在:



[0129] 总体上,具有式 (I\*\*) 的化合物比具有式 (I\*) 的化合物更具生物活性。本发明包括化合物 (I\*) 与化合物 (I\*\*) 以任何比率的混合物,例如其摩尔比为1:99至99:1,例如10:1至1:10,例如大体上50:50的摩尔比。在富含对映异构体(或差向异构体)的具有式 (I\*\*) 的混合物中,与两种对映异构体(或差向异构体)的总量相比,具有式 (I\*\*) 的化合物的摩尔比例是例如大于50%,例如至少55%、60%、65%、70%、75%、80%、85%、90%、95%、96%、97%、98%或至少99%。同样地,在富含对映异构体(或差向异构体)的具有式 (I\*) 的混合物中,与两种对映异构体(或差向异构体)的总量相比,具有式 (I\*) 的化合物的摩尔比例是例如大于50%,例如至少55%、60%、65%、70%、75%、80%、85%、90%、95%、96%、97%、98%或至少99%。富含对映异构体(或差向异构体)的具有式 (I\*\*) 的混合物是优选的。

[0130] 具有式 (I) 的这些化合物的盐能以本身已知的方式进行制备。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。

[0131] 具有式 (I) 的化合物的盐能以常规方式转化为游离的化合物I、酸加成盐(例如通过用合适的碱性化合物或用合适的离子交换试剂进行处理)以及碱盐(例如通过用合适的酸或用合适的离子交换试剂进行处理)。

[0132] 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。

[0133] 取决于程序或反应条件,具有成盐特性的这些具有式 (I) 的化合物能以游离形式或盐的形式获得。

[0134] 可以通过使具有式 (I) 的化合物与适合的氧化剂(例如H<sub>2</sub>O<sub>2</sub>/尿素加合物)在酸酐(例如三氟乙酸酐)的存在下进行反应来制备N-氧化物。此类氧化从文献,例如从J. Med. Chem. [药物化学杂志] 1989, 32, 2561或W0 2000/15615已知。

[0135] 有利的是在每一情况中分离或合成生物学地更有效的异构体,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,如果个别组分具有不同的生物活性。

[0136] 具有式 (I) 的化合物和适当时其互变异构体(在每种情况下处于游离形式或处于盐形式)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

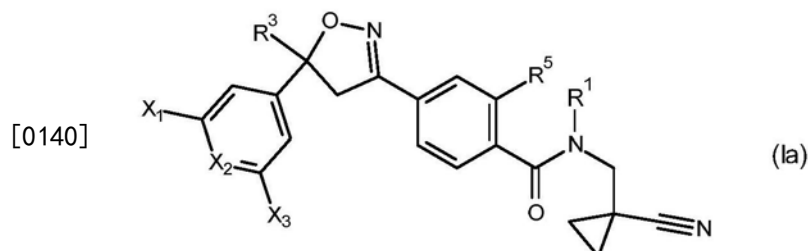


体形式存在的化合物结晶的那些。

[0137] 根据以下表1到162所述的化合物可以根据上述方法来制备。随后的这些实例旨在说明本发明并且展示优选的具有式(I)的化合物。

[0138] 表1至表54:具有式(Ia)的化合物

[0139] 通过使以下在下表1至表54中列出的具有式(Ia)的个体化合物可得,对本发明做了进一步地说明。



[0141] 在以下的表P下面的表1至54的每一个使得具有式(Ia)的250种化合物可得,其中 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 和 $R^5$ 是在表P中定义的取代基,并且 $R^1$ 和 $X_2$ 是在有关的表1至54中所定义的取代基。因此,表1个体化了250种具有式(Ia)的化合物,其中对于表P的每一行, $R^1$ 和 $X_2$ 取代基是如在表1中所定义的;类似地,表2个体化了250种具有式(Ia)的化合物,其中对于表P的每一行, $R^1$ 和 $X_2$ 取代基是如在表2中所定义的;表3至54以此类推。

[0142] 在表1至表54中披露的每种化合物代表根据具有式(I\*)的化合物的一种化合物的披露,以及根据具有式(I\*\*)的化合物连同其混合物的披露。

[0143] 表P

[0144]

	X <sub>3</sub>	R <sup>3</sup>	X <sub>1</sub>	R <sup>5</sup>
1	H	CF <sub>3</sub>	H	Me
2	Cl	CF <sub>3</sub>	H	Me
3	Br	CF <sub>3</sub>	H	Me
4	F	CF <sub>3</sub>	H	Me
5	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	Me
6	H	CF <sub>2</sub> Cl	H	Me
7	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	H	Me
8	Br	CF <sub>2</sub> Cl	H	Me
9	F	CF <sub>2</sub> Cl	H	Me
10	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	H	Me
11	H	CF <sub>3</sub>	Cl	Me
12	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Me
13	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Me
14	F	CF <sub>3</sub>	Cl	Me
15	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	Me
16	H	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	Me
17	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	Me
18	Br	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	Me
19	F	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	Me
20	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	Me
21	H	CF <sub>3</sub>	Br	Me
22	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Me
23	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Me
24	F	CF <sub>3</sub>	Br	Me
25	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	Me
26	H	CF <sub>2</sub> Cl	Br	Me
27	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	Br	Me
28	Br	CF <sub>2</sub> Cl	Br	Me
29	F	CF <sub>2</sub> Cl	Br	Me
30	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	Br	Me
31	H	CF <sub>3</sub>	F	Me
32	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Me
33	Br	CF <sub>3</sub>	F	Me
34	F	CF <sub>3</sub>	F	Me
35	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	Me
36	H	CF <sub>2</sub> Cl	F	Me
37	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	F	Me

	X <sub>3</sub>	R <sup>3</sup>	X <sub>1</sub>	R <sup>5</sup>
38	Br	CF <sub>2</sub> Cl	F	Me
39	F	CF <sub>2</sub> Cl	F	Me
40	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	F	Me
41	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
42	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
43	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
44	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
45	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Me
46	H	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	Me
47	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	Me
48	Br	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	Me
49	F	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	Me
50	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	Me
51	H	CF <sub>3</sub>	H	Cl
52	Cl	CF <sub>3</sub>	H	Cl
53	Br	CF <sub>3</sub>	H	Cl
54	F	CF <sub>3</sub>	H	Cl
55	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	Cl
56	H	CF <sub>2</sub> Cl	H	Cl
57	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	H	Cl
58	Br	CF <sub>2</sub> Cl	H	Cl
59	F	CF <sub>2</sub> Cl	H	Cl
60	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	H	Cl
61	H	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl
62	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl
63	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl
64	F	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl
65	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	Cl
66	H	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	Cl
67	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	Cl
68	Br	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	Cl
69	F	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	Cl
70	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	Cl
71	H	CF <sub>3</sub>	Br	Cl
72	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Cl
73	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Cl
74	F	CF <sub>3</sub>	Br	Cl
75	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	Cl

[0145]

	X <sub>3</sub>	R <sup>3</sup>	X <sub>1</sub>	R <sup>5</sup>
76	H	CF <sub>2</sub> Cl	Br	Cl
77	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	Br	Cl
78	Br	CF <sub>2</sub> Cl	Br	Cl
79	F	CF <sub>2</sub> Cl	Br	Cl
80	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	Br	Cl
81	H	CF <sub>3</sub>	F	Cl
82	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Cl
83	Br	CF <sub>3</sub>	F	Cl
84	F	CF <sub>3</sub>	F	Cl
85	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	Cl
86	H	CF <sub>2</sub> Cl	F	Cl
87	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	F	Cl
88	Br	CF <sub>2</sub> Cl	F	Cl
89	F	CF <sub>2</sub> Cl	F	Cl
90	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	F	Cl
91	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
92	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
93	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
94	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
95	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl
96	H	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
97	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
98	Br	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
99	F	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
100	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
101	H	CF <sub>3</sub>	H	Br
102	Cl	CF <sub>3</sub>	H	Br
103	Br	CF <sub>3</sub>	H	Br
104	F	CF <sub>3</sub>	H	Br
105	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	Br
106	H	CF <sub>2</sub> Cl	H	Br
107	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	H	Br
108	Br	CF <sub>2</sub> Cl	H	Br
109	F	CF <sub>2</sub> Cl	H	Br
110	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	H	Br
111	H	CF <sub>3</sub>	Cl	Br
112	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	Br
113	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	Br

	X <sub>3</sub>	R <sup>3</sup>	X <sub>1</sub>	R <sup>5</sup>
114	F	CF <sub>3</sub>	Cl	Br
115	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	Br
116	H	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	Br
117	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	Br
118	Br	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	Br
119	F	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	Br
120	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	Br
121	H	CF <sub>3</sub>	Br	Br
122	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	Br
123	Br	CF <sub>3</sub>	Br	Br
124	F	CF <sub>3</sub>	Br	Br
125	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	Br
126	H	CF <sub>2</sub> Cl	Br	Br
127	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	Br	Br
128	Br	CF <sub>2</sub> Cl	Br	Br
129	F	CF <sub>2</sub> Cl	Br	Br
130	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	Br	Br
131	H	CF <sub>3</sub>	F	Br
132	Cl	CF <sub>3</sub>	F	Br
133	Br	CF <sub>3</sub>	F	Br
134	F	CF <sub>3</sub>	F	Br
135	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	Br
136	H	CF <sub>2</sub> Cl	F	Br
137	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	F	Br
138	Br	CF <sub>2</sub> Cl	F	Br
139	F	CF <sub>2</sub> Cl	F	Br
140	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	F	Br
141	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
142	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
143	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
144	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
145	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br
146	H	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	Br
147	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	Br
148	Br	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	Br
149	F	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	Br
150	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	Br
151	H	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>

[0146]

	X <sub>3</sub>	R <sup>3</sup>	X <sub>1</sub>	R <sup>5</sup>
152	Cl	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>
153	Br	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>
154	F	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>
155	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>
156	H	CF <sub>2</sub> Cl	H	CF <sub>3</sub>
157	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	H	CF <sub>3</sub>
158	Br	CF <sub>2</sub> Cl	H	CF <sub>3</sub>
159	F	CF <sub>2</sub> Cl	H	CF <sub>3</sub>
160	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	H	CF <sub>3</sub>
161	H	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
162	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
163	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
164	F	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
165	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>
166	H	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	CF <sub>3</sub>
167	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	CF <sub>3</sub>
168	Br	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	CF <sub>3</sub>
169	F	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	CF <sub>3</sub>
170	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	CF <sub>3</sub>
171	H	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
172	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
173	Br	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
174	F	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
175	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	CF <sub>3</sub>
176	H	CF <sub>2</sub> Cl	Br	CF <sub>3</sub>
177	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	Br	CF <sub>3</sub>
178	Br	CF <sub>2</sub> Cl	Br	CF <sub>3</sub>
179	F	CF <sub>2</sub> Cl	Br	CF <sub>3</sub>
180	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	Br	CF <sub>3</sub>
181	H	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>
182	Cl	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>
183	Br	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>
184	F	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>
185	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>
186	H	CF <sub>2</sub> Cl	F	CF <sub>3</sub>
187	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	F	CF <sub>3</sub>
188	Br	CF <sub>2</sub> Cl	F	CF <sub>3</sub>
189	F	CF <sub>2</sub> Cl	F	CF <sub>3</sub>

	X <sub>3</sub>	R <sup>3</sup>	X <sub>1</sub>	R <sup>5</sup>
190	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	F	CF <sub>3</sub>
191	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
192	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
193	Br	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
194	F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
195	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
196	H	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
197	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
198	Br	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
199	F	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
200	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
201	H	CF <sub>3</sub>	H	F
202	Cl	CF <sub>3</sub>	H	F
203	Br	CF <sub>3</sub>	H	F
204	F	CF <sub>3</sub>	H	F
205	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	F
206	H	CF <sub>2</sub> Cl	H	F
207	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	H	F
208	Br	CF <sub>2</sub> Cl	H	F
209	F	CF <sub>2</sub> Cl	H	F
210	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	H	F
211	H	CF <sub>3</sub>	Cl	F
212	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	F
213	Br	CF <sub>3</sub>	Cl	F
214	F	CF <sub>3</sub>	Cl	F
215	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Cl	F
216	H	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	F
217	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	F
218	Br	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	F
219	F	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	F
220	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	F
221	H	CF <sub>3</sub>	Br	F
222	Cl	CF <sub>3</sub>	Br	F
223	Br	CF <sub>3</sub>	Br	F
224	F	CF <sub>3</sub>	Br	F
225	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	F
226	H	CF <sub>2</sub> Cl	Br	F
227	Cl	CF <sub>2</sub> Cl	Br	F

[0147]

	<b>X<sub>3</sub></b>	<b>R<sup>3</sup></b>	<b>X<sub>1</sub></b>	<b>R<sup>5</sup></b>
<b>228</b>	<b>Br</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>Br</b>	<b>F</b>
<b>229</b>	<b>F</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>Br</b>	<b>F</b>
<b>230</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>Br</b>	<b>F</b>
<b>231</b>	<b>H</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>	<b>F</b>
<b>232</b>	<b>Cl</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>	<b>F</b>
<b>233</b>	<b>Br</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>	<b>F</b>
<b>234</b>	<b>F</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>	<b>F</b>
<b>235</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>	<b>F</b>
<b>236</b>	<b>H</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>F</b>	<b>F</b>
<b>237</b>	<b>Cl</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>F</b>	<b>F</b>
<b>238</b>	<b>Br</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>F</b>	<b>F</b>
<b>239</b>	<b>F</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>F</b>	<b>F</b>
<b>240</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>F</b>	<b>F</b>
<b>241</b>	<b>H</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>
<b>242</b>	<b>Cl</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>
<b>243</b>	<b>Br</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>
<b>244</b>	<b>F</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>
<b>245</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>
<b>246</b>	<b>H</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>
<b>247</b>	<b>Cl</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>
<b>248</b>	<b>Br</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>
<b>249</b>	<b>F</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>
<b>250</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>

[0148] 表1

[0149] 表1提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是氢, X<sub>2</sub>是N, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0150] 表2

[0151] 表2提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是氢, X<sub>2</sub>是CH, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0152] 表3

[0153] 表3提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是氢, X<sub>2</sub>是C-F, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0154] 表4

[0155] 表4提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是氢, X<sub>2</sub>是C-Br, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0156] 表5

[0157] 表5提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是氢, X<sub>2</sub>是C-Cl, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0158] 表6

[0159] 表6提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是氢, X<sub>2</sub>是C-CF<sub>3</sub>, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是

如在表P中所定义的。

[0160] 表7

[0161] 表7提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2CN$ ,  $X_2$ 是N, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0162] 表8

[0163] 表8提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2CN$ ,  $X_2$ 是CH, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0164] 表9

[0165] 表9提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2CN$ ,  $X_2$ 是C-F, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0166] 表10

[0167] 表10提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2CN$ ,  $X_2$ 是C-Br, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0168] 表11

[0169] 表11提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2CN$ ,  $X_2$ 是C-Cl, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0170] 表12

[0171] 表12提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2CN$ ,  $X_2$ 是C- $CF_3$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0172] 表13

[0173] 表13提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_3$ ,  $X_2$ 是N, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0174] 表14

[0175] 表14提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_3$ ,  $X_2$ 是CH, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0176] 表15

[0177] 表15提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_3$ ,  $X_2$ 是C-F, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0178] 表16

[0179] 表16提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_3$ ,  $X_2$ 是C-Br, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0180] 表17

[0181] 表17提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_3$ ,  $X_2$ 是C-Cl, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0182] 表18

[0183] 表18提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_3$ ,  $X_2$ 是C- $CF_3$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0184] 表19

[0185] 表19提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_2CH_3$ ,  $X_2$ 是N, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、

R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0186] 表20

[0187] 表20提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, X<sub>2</sub>是CH, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0188] 表21

[0189] 表21提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, X<sub>2</sub>是C-F, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0190] 表22

[0191] 表22提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, X<sub>2</sub>是C-Br, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0192] 表23

[0193] 表23提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, X<sub>2</sub>是C-Cl, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0194] 表24

[0195] 表24提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, X<sub>2</sub>是C-CF<sub>3</sub>, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0196] 表25

[0197] 表25提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是C(O)OCH<sub>3</sub>, X<sub>2</sub>是N, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0198] 表26

[0199] 表26提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是C(O)OCH<sub>3</sub>, X<sub>2</sub>是CH, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0200] 表27

[0201] 表27提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是C(O)OCH<sub>3</sub>, X<sub>2</sub>是C-F, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0202] 表28

[0203] 表28提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是C(O)OCH<sub>3</sub>, X<sub>2</sub>是C-Br, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0204] 表29

[0205] 表29提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是C(O)OCH<sub>3</sub>, X<sub>2</sub>是C-Cl, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0206] 表30

[0207] 表30提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是C(O)OCH<sub>3</sub>, X<sub>2</sub>是C-CF<sub>3</sub>, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0208] 表31

[0209] 表31提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是C(O)OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, X<sub>2</sub>是N, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0210] 表32

[0211] 表32提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是C(O)OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, X<sub>2</sub>是CH, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、

$X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0212] 表33

[0213] 表33提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $C(O)OCH_2CH_3$ ,  $X_2$ 是 $C-F$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0214] 表34

[0215] 表34提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $C(O)OCH_2CH_3$ ,  $X_2$ 是 $C-Br$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0216] 表35

[0217] 表35提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $C(O)OCH_2CH_3$ ,  $X_2$ 是 $C-Cl$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0218] 表36

[0219] 表36提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $C(O)OCH_2CH_3$ ,  $X_2$ 是 $C-CF_3$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0220] 表37

[0221] 表37提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH_3$ ,  $X_2$ 是 $N$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0222] 表38

[0223] 表38提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH_3$ ,  $X_2$ 是 $CH$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0224] 表39

[0225] 表39提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH_3$ ,  $X_2$ 是 $C-F$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0226] 表40

[0227] 表40提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH_3$ ,  $X_2$ 是 $C-Br$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0228] 表41

[0229] 表41提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH_3$ ,  $X_2$ 是 $C-Cl$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0230] 表42

[0231] 表42提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH_3$ ,  $X_2$ 是 $C-CF_3$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0232] 表43

[0233] 表43提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH(CH_3)_2$ ,  $X_2$ 是 $N$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0234] 表44

[0235] 表44提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH(CH_3)_2$ ,  $X_2$ 是 $CH$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0236] 表45

[0237] 表45提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH(CH_3)_2$ ,  $X_2$ 是 $C-F$ , 并且



$X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0238] 表46

[0239] 表46提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH(CH_3)_2$ ,  $X_2$ 是C-Br, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0240] 表47

[0241] 表47提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH(CH_3)_2$ ,  $X_2$ 是C-Cl, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0242] 表48

[0243] 表48提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH(CH_3)_2$ ,  $X_2$ 是C-CF<sub>3</sub>, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0244] 表49

[0245] 表49提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ ,  $X_2$ 是N, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0246] 表50

[0247] 表50提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ ,  $X_2$ 是CH, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0248] 表51

[0249] 表51提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ ,  $X_2$ 是C-F, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0250] 表52

[0251] 表52提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ ,  $X_2$ 是C-Br, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0252] 表53

[0253] 表53提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ ,  $X_2$ 是C-Cl, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0254] 表54

[0255] 表54提供了250种具有式 (Ia) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ ,  $X_2$ 是C-CF<sub>3</sub>, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

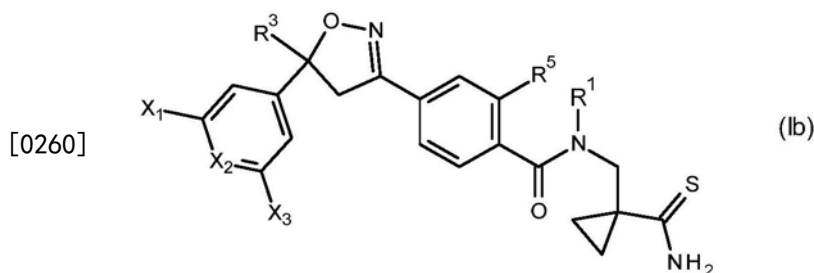
[0256] 使得具有式 (Int-Ia) 的化合物可得的实例是以下那些, 其中 $X^B$ 是溴、氯、碘、氰基、甲酰基、CH=NOH或乙酰基,  $A^2$ 、 $A^3$ 和 $A^4$ 各自是CH,  $n$ 是2,  $A^1$ 是CR<sup>5</sup>, 并且其中 $R^1$ 和 $R^5$ 对应于是如以上文式 (Ia) 的背景中的表1至54的每一个中所定义的取代基 $R^1$ 和 $R^5$ 。例如, 表1个体化了具有式 (Int-I) 的化合物, 其中 $X^B$ 是溴、氯、碘、氰基、甲酰基、CH=NOH或乙酰基,  $A^2$ 、 $A^3$ 和 $A^4$ 各自是CH,  $n$ 是2,  $A^1$ 是CR<sup>5</sup>, 并且其中 $R^1$ 和 $R^5$ 是如在表1中所定义的; 类似地, 表2个体化了具有式 (Int-I) 的化合物, 其中 $X^B$ 是溴、氯、碘、氰基、甲酰基、CH=NOH或乙酰基,  $A^2$ 、 $A^3$ 和 $A^4$ 各自是CH,  $n$ 是2,  $A^1$ 是CR<sup>5</sup>, 并且其中 $R^1$ 和 $R^5$ 是如在表2中所定义的; 表3至54以此类推。

[0257] 使得具有式 (Int-IIa) 的化合物可得的实例是以下那些, 其中 $X^C$ 是CH<sub>2</sub>Cl、CH<sub>2</sub>Br、CH=C(CF<sub>3</sub>) (3-氯-5-三氟甲基-苯基)、CH=C(CF<sub>3</sub>) (3-溴-5-三氟甲基-苯基)、CH=C(CF<sub>3</sub>) (3, 5-二氯-4-氟-苯基)、CH=C(CF<sub>3</sub>) (3, 4, 5-三氯-苯基)、CH<sub>2</sub>C(OH)(CF<sub>3</sub>) (3-氯-5-三氟甲基-苯基)、CH<sub>2</sub>C(OH)(CF<sub>3</sub>) (3-溴-5-三氟甲基-苯基)、CH<sub>2</sub>C(OH)(CF<sub>3</sub>) (3, 5-二氯-4-氟-苯基) 或CH<sub>2</sub>C

(OH) (CF<sub>3</sub>) (3,4,5-三氯-苯基), A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>和A<sup>4</sup>各自是CH, n是2, A<sup>1</sup>是CR<sup>5</sup>, 并且R<sup>1</sup>和R<sup>5</sup>对应于如上文式 (Ia) 的背景中的表1至54的每个所定义的取代基R<sup>1</sup>和R<sup>5</sup>。例如, 表1个体化了具有式 (Int-II) 的化合物, 其中X<sup>c</sup>是CH<sub>2</sub>Cl、CH<sub>2</sub>Br、CH=C (CF<sub>3</sub>) (3-氯-5-三氟甲基-苯基)、CH=C (CF<sub>3</sub>) (3-溴-5-三氟甲基-苯基)、CH=C (CF<sub>3</sub>) (3,5-二氯-4-氟-苯基)、CH=C (CF<sub>3</sub>) (3,4,5-三氯-苯基)、CH<sub>2</sub>C (OH) (CF<sub>3</sub>) (3-氯-5-三氟甲基-苯基)、CH<sub>2</sub>C (OH) (CF<sub>3</sub>) (3-溴-5-三氟甲基-苯基)、CH<sub>2</sub>C (OH) (CF<sub>3</sub>) (3,5-二氯-4-氟-苯基) 或CH<sub>2</sub>C (OH) (CF<sub>3</sub>) (3,4,5-三氯-苯基), A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>和A<sup>4</sup>各自是CH, n是2, A<sup>1</sup>是CR<sup>5</sup>, 并且其中R<sup>1</sup>和R<sup>5</sup>是如在表1中所定义的; 类似地, 表2个体化了具有式 (Int-II) 的化合物, 其中X<sup>c</sup>是CH<sub>2</sub>Cl、CH<sub>2</sub>Br、CH=C (CF<sub>3</sub>) (3-氯-5-三氟甲基-苯基)、CH=C (CF<sub>3</sub>) (3-溴-5-三氟甲基-苯基)、CH=C (CF<sub>3</sub>) (3,5-二氯-4-氟-苯基)、CH=C (CF<sub>3</sub>) (3,4,5-三氯-苯基)、CH<sub>2</sub>C (OH) (CF<sub>3</sub>) (3-氯-5-三氟甲基-苯基)、CH<sub>2</sub>C (OH) (CF<sub>3</sub>) (3-溴-5-三氟甲基-苯基)、CH<sub>2</sub>C (OH) (CF<sub>3</sub>) (3,5-二氯-4-氟-苯基) 或CH<sub>2</sub>C (OH) (CF<sub>3</sub>) (3,4,5-三氯-苯基), A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>和A<sup>4</sup>各自是CH, n是2, A<sup>1</sup>是CR<sup>5</sup>, 并且其中R<sup>1</sup>和R<sup>5</sup>是如在表2中所定义的; 表3至54以此类推。

[0258] 表55至108: 具有式 (Ib) 的化合物

[0259] 通过使以下在表55至表108中列出的具有式 (Ib) 的个体化合物可得, 对本发明做了进一步地说明。



[0261] 在以上的表P下面的表55至108的每个使得具有式 (Ib) 的250种化合物可得, 其中X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>和R<sup>5</sup>是在表P中所定义的取代基, 并且R<sup>1</sup>和X<sub>2</sub>是在有关的表55至108中所定义的取代基。因此, 表55个体化了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中对于表P的每一行, R<sup>1</sup>和X<sub>2</sub>取代基是如在表55中所定义的; 类似地, 表56个体化了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中对于表P的每一行, R<sup>1</sup>和X<sub>2</sub>取代基是如在表56中所定义的; 表57至108以此类推。

[0262] 表55

[0263] 表56提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是氢, X<sub>2</sub>是N, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0264] 表56

[0265] 表56提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是氢, X<sub>2</sub>是CH, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0266] 表57

[0267] 表57提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是氢, X<sub>2</sub>是C-F, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0268] 表58

[0269] 表58提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中R<sup>1</sup>是氢, X<sub>2</sub>是C-Br, 并且X<sub>3</sub>、R<sup>3</sup>、X<sub>1</sub>、R<sup>5</sup>是如在表P中所定义的。

[0270] 表59

[0271] 表59提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是氢, $X_2$ 是C-Cl,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0272] 表60

[0273] 表60提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是氢, $X_2$ 是C-CF<sub>3</sub>,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0274] 表61

[0275] 表61提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>CN, $X_2$ 是N,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0276] 表62

[0277] 表62提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>CN, $X_2$ 是CH,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0278] 表63

[0279] 表63提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>CN, $X_2$ 是C-F,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0280] 表64

[0281] 表64提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>CN, $X_2$ 是C-Br,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0282] 表65

[0283] 表65提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>CN, $X_2$ 是C-Cl,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0284] 表66

[0285] 表66提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>CN, $X_2$ 是C-CF<sub>3</sub>,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0286] 表67

[0287] 表67提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, $X_2$ 是N,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0288] 表68

[0289] 表68提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, $X_2$ 是CH,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0290] 表69

[0291] 表69提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, $X_2$ 是C-F,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0292] 表70

[0293] 表70提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, $X_2$ 是C-Br,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0294] 表71

[0295] 表71提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, $X_2$ 是C-Cl,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0296] 表72

[0297] 表72提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_3$ ,  $X_2$ 是 $C-CF_3$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0298] 表73

[0299] 表73提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_2CH_3$ ,  $X_2$ 是 $N$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0300] 表74

[0301] 表74提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_2CH_3$ ,  $X_2$ 是 $CH$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0302] 表75

[0303] 表75提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_2CH_3$ ,  $X_2$ 是 $C-F$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0304] 表76

[0305] 表76提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_2CH_3$ ,  $X_2$ 是 $C-Br$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0306] 表77

[0307] 表77提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_2CH_3$ ,  $X_2$ 是 $C-Cl$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0308] 表78

[0309] 表78提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_2CH_3$ ,  $X_2$ 是 $C-CF_3$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0310] 表79

[0311] 表79提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $C(O)OCH_3$ ,  $X_2$ 是 $N$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0312] 表80

[0313] 表80提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $C(O)OCH_3$ ,  $X_2$ 是 $CH$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0314] 表81

[0315] 表81提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $C(O)OCH_3$ ,  $X_2$ 是 $C-F$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0316] 表82

[0317] 表82提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $C(O)OCH_3$ ,  $X_2$ 是 $C-Br$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0318] 表83

[0319] 表83提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $C(O)OCH_3$ ,  $X_2$ 是 $C-Cl$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0320] 表84

[0321] 表84提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $C(O)OCH_3$ ,  $X_2$ 是 $C-CF_3$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0322] 表85

[0323] 表85提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是C(O)OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, $X_2$ 是N,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0324] 表86

[0325] 表86提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是C(O)OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, $X_2$ 是CH,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0326] 表87

[0327] 表87提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是C(O)OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, $X_2$ 是C-F,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0328] 表88

[0329] 表88提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是C(O)OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, $X_2$ 是C-Br,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0330] 表89

[0331] 表89提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是C(O)OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, $X_2$ 是C-Cl,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0332] 表90

[0333] 表90提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是C(O)OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, $X_2$ 是C-CF<sub>3</sub>,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0334] 表91

[0335] 表91提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>OC(O)CH<sub>3</sub>, $X_2$ 是N,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0336] 表92

[0337] 表92提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>OC(O)CH<sub>3</sub>, $X_2$ 是CH,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0338] 表93

[0339] 表93提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>OC(O)CH<sub>3</sub>, $X_2$ 是C-F,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0340] 表94

[0341] 表94提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>OC(O)CH<sub>3</sub>, $X_2$ 是C-Br,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0342] 表95

[0343] 表95提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>OC(O)CH<sub>3</sub>, $X_2$ 是C-Cl,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0344] 表96

[0345] 表96提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>OC(O)CH<sub>3</sub>, $X_2$ 是C-CF<sub>3</sub>,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0346] 表97

[0347] 表97提供了250种具有式 (Ib) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>OC(O)CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, $X_2$ 是N,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0348] 表98

[0349] 表98提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH(CH_3)_2$ ,  $X_2$ 是CH, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0350] 表99

[0351] 表99提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH(CH_3)_2$ ,  $X_2$ 是C-F, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0352] 表100

[0353] 表100提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH(CH_3)_2$ ,  $X_2$ 是C-Br, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0354] 表101

[0355] 表101提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH(CH_3)_2$ ,  $X_2$ 是C-Cl, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0356] 表102

[0357] 表102提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH(CH_3)_2$ ,  $X_2$ 是C-CF<sub>3</sub>, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0358] 表103

[0359] 表103提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ ,  $X_2$ 是N, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0360] 表104

[0361] 表104提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ ,  $X_2$ 是CH, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0362] 表105

[0363] 表105提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ ,  $X_2$ 是C-F, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0364] 表106

[0365] 表106提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ ,  $X_2$ 是C-Br, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0366] 表107

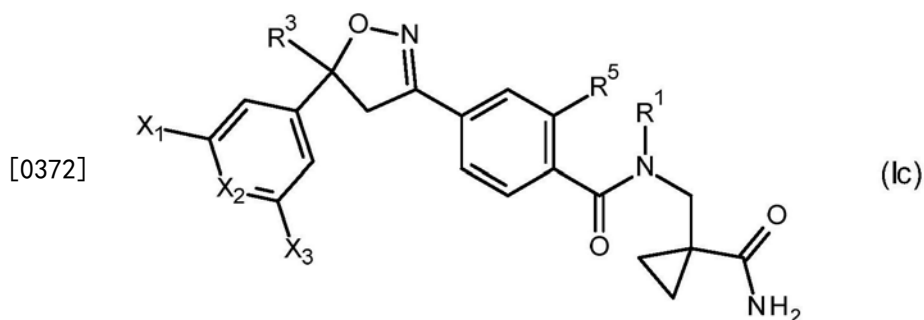
[0367] 表107提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ ,  $X_2$ 是C-Cl, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0368] 表108

[0369] 表108提供了250种具有式 (Ib) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ ,  $X_2$ 是C-CF<sub>3</sub>, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0370] 表109至162: 具有式 (Ic) 的化合物

[0371] 通过使以下在表109至表162中列出的具有式 (Ic) 的个体化合物可得, 对本发明做了进一步地说明。



[0373] 在以上的表P下面的表109至162的每一个使得具有式 (Ic) 的250种化合物可得,其中 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 和 $R^5$ 是在表P中所定义的取代基,并且 $R^1$ 和 $X_2$ 是在有关的表109至162中所定义的取代基。因此,表109个体化了250种具有式 (Ic) 的化合物,其中对于表P的每一行, $R^1$ 和 $X_2$ 取代基是如在表109中所定义的;类似地,表110个体化了250种具有式 (Ic) 的化合物,其中对于表P的每一行, $R^1$ 和 $X_2$ 取代基是如在表110中所定义的;表111至162以此类推。

[0374] 表109

[0375] 表109提供了250种具有式 (Ic) 的化合物,其中 $R^1$ 是氢, $X_2$ 是N,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0376] 表110

[0377] 表110提供了250种具有式 (Ic) 的化合物,其中 $R^1$ 是氢, $X_2$ 是CH,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0378] 表111

[0379] 表111提供了250种具有式 (Ic) 的化合物,其中 $R^1$ 是氢, $X_2$ 是C-F,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0380] 表112

[0381] 表112提供了250种具有式 (Ic) 的化合物,其中 $R^1$ 是氢, $X_2$ 是C-Br,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0382] 表113

[0383] 表113提供了250种具有式 (Ic) 的化合物,其中 $R^1$ 是氢, $X_2$ 是C-Cl,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0384] 表114

[0385] 表114提供了250种具有式 (Ic) 的化合物,其中 $R^1$ 是氢, $X_2$ 是C-CF<sub>3</sub>,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0386] 表115

[0387] 表115提供了250种具有式 (Ic) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>CN, $X_2$ 是N,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0388] 表116

[0389] 表116提供了250种具有式 (Ic) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>CN, $X_2$ 是CH,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0390] 表117

[0391] 表117提供了250种具有式 (Ic) 的化合物,其中 $R^1$ 是CH<sub>2</sub>CN, $X_2$ 是C-F,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0392] 表118

[0393] 表118提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2CN$ ,  $X_2$ 是C-Br, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0394] 表119

[0395] 表119提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2CN$ ,  $X_2$ 是C-Cl, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0396] 表120

[0397] 表120提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2CN$ ,  $X_2$ 是C- $CF_3$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0398] 表121

[0399] 表121提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_3$ ,  $X_2$ 是N, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0400] 表122

[0401] 表122提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_3$ ,  $X_2$ 是CH, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0402] 表123

[0403] 表123提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_3$ ,  $X_2$ 是C-F, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0404] 表124

[0405] 表124提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_3$ ,  $X_2$ 是C-Br, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0406] 表125

[0407] 表125提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_3$ ,  $X_2$ 是C-Cl, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0408] 表126

[0409] 表126提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_3$ ,  $X_2$ 是C- $CF_3$ , 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0410] 表127

[0411] 表127提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_2CH_3$ ,  $X_2$ 是N, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0412] 表128

[0413] 表128提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_2CH_3$ ,  $X_2$ 是CH, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0414] 表129

[0415] 表129提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_2CH_3$ ,  $X_2$ 是C-F, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0416] 表130

[0417] 表130提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_2CH_3$ ,  $X_2$ 是C-Br, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。



[0418] 表131

[0419] 表131提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_2CH_3$ ,  $X_2$ 是C-Cl, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0420] 表132

[0421] 表132提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OCH_2CH_3$ ,  $X_2$ 是C-CF<sub>3</sub>, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0422] 表133

[0423] 表133提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是C(O)OCH<sub>3</sub>,  $X_2$ 是N, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0424] 表134

[0425] 表134提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是C(O)OCH<sub>3</sub>,  $X_2$ 是CH, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0426] 表135

[0427] 表135提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是C(O)OCH<sub>3</sub>,  $X_2$ 是C-F, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0428] 表136

[0429] 表136提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是C(O)OCH<sub>3</sub>,  $X_2$ 是C-Br, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0430] 表137

[0431] 表137提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是C(O)OCH<sub>3</sub>,  $X_2$ 是C-Cl, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0432] 表138

[0433] 表138提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是C(O)OCH<sub>3</sub>,  $X_2$ 是C-CF<sub>3</sub>, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0434] 表139

[0435] 表139提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是C(O)OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,  $X_2$ 是N, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0436] 表140

[0437] 表140提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是C(O)OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,  $X_2$ 是CH, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0438] 表141

[0439] 表141提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是C(O)OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,  $X_2$ 是C-F, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0440] 表142

[0441] 表142提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是C(O)OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,  $X_2$ 是C-Br, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0442] 表143

[0443] 表143提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是C(O)OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,  $X_2$ 是C-Cl, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0444] 表144

[0445] 表144提供了250种具有式(Ic)的化合物,其中 $R^1$ 是 $C(O)OCH_2CH_3$ , $X_2$ 是 $C-CF_3$ ,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0446] 表145

[0447] 表145提供了250种具有式(Ic)的化合物,其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH_3$ , $X_2$ 是N,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0448] 表146

[0449] 表146提供了250种具有式(Ic)的化合物,其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH_3$ , $X_2$ 是CH,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0450] 表147

[0451] 表147提供了250种具有式(Ic)的化合物,其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH_3$ , $X_2$ 是C-F,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0452] 表148

[0453] 表148提供了250种具有式(Ic)的化合物,其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH_3$ , $X_2$ 是C-Br,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0454] 表149

[0455] 表149提供了250种具有式(Ic)的化合物,其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH_3$ , $X_2$ 是C-Cl,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0456] 表150

[0457] 表150提供了250种具有式(Ic)的化合物,其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH_3$ , $X_2$ 是 $C-CF_3$ ,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0458] 表151

[0459] 表151提供了250种具有式(Ic)的化合物,其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH(CH_3)_2$ , $X_2$ 是N,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0460] 表152

[0461] 表152提供了250种具有式(Ic)的化合物,其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH(CH_3)_2$ , $X_2$ 是CH,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0462] 表153

[0463] 表153提供了250种具有式(Ic)的化合物,其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH(CH_3)_2$ , $X_2$ 是C-F,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0464] 表154

[0465] 表154提供了250种具有式(Ic)的化合物,其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH(CH_3)_2$ , $X_2$ 是C-Br,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0466] 表155

[0467] 表155提供了250种具有式(Ic)的化合物,其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH(CH_3)_2$ , $X_2$ 是C-Cl,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0468] 表156

[0469] 表156提供了250种具有式(Ic)的化合物,其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)CH(CH_3)_2$ , $X_2$ 是 $C-CF_3$ ,并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0470] 表157

[0471] 表157提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ ,  $X_2$ 是N, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0472] 表158

[0473] 表158提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ ,  $X_2$ 是CH, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0474] 表159

[0475] 表159提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ ,  $X_2$ 是C-F, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0476] 表160

[0477] 表160提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ ,  $X_2$ 是C-Br, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0478] 表161

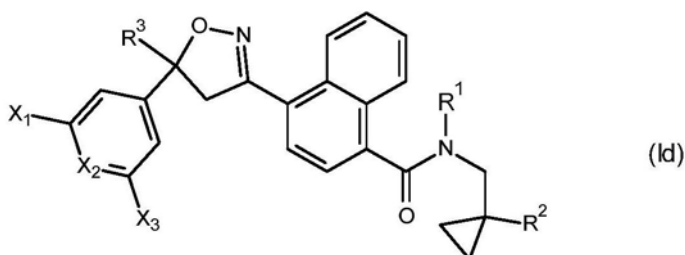
[0479] 表161提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ ,  $X_2$ 是C-Cl, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0480] 表162

[0481] 表162提供了250种具有式 (Ic) 的化合物, 其中 $R^1$ 是 $CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ ,  $X_2$ 是C-CF<sub>3</sub>, 并且 $X_3$ 、 $R^3$ 、 $X_1$ 、 $R^5$ 是如在表P中所定义的。

[0482] 通过使以下在表B-1至B-270中列出的具有式 (Id) 的个体化合物可得, 对本发明做了进一步地说明。

[0483]



(Id)

[0484] 表P1:  $R^2$ 、 $R^3$ 、 $X_3$ 和 $R^1$ 的取代基定义:

[0485]

	<b>R<sup>3</sup></b>	<b>X<sub>3</sub></b>	<b>R<sup>2</sup></b>	<b>R<sup>1</sup></b>
<b>1</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>H</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>
<b>2</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>Cl</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>
<b>3</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>Br</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>
<b>4</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>
<b>5</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>CN</b>	<b>H</b>
<b>6</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>H</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>
<b>7</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>Cl</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>
<b>8</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>Br</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>
<b>9</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>F</b>	<b>CN</b>	<b>H</b>
<b>10</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>CN</b>	<b>H</b>
<b>11</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>H</b>	<b>C(O)NH<sub>2</sub></b>	<b>H</b>
<b>12</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>Cl</b>	<b>C(O)NH<sub>2</sub></b>	<b>H</b>
<b>13</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>Br</b>	<b>C(O)NH<sub>2</sub></b>	<b>H</b>
<b>14</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>	<b>C(O)NH<sub>2</sub></b>	<b>H</b>
<b>15</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>C(O)NH<sub>2</sub></b>	<b>H</b>
<b>16</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>H</b>	<b>C(O)NH<sub>2</sub></b>	<b>H</b>
<b>17</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>Cl</b>	<b>C(O)NH<sub>2</sub></b>	<b>H</b>
<b>18</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>Br</b>	<b>C(O)NH<sub>2</sub></b>	<b>H</b>
<b>19</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>F</b>	<b>C(O)NH<sub>2</sub></b>	<b>H</b>
<b>20</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>C(O)NH<sub>2</sub></b>	<b>H</b>
<b>21</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>H</b>	<b>C(S)NH<sub>2</sub></b>	<b>H</b>
<b>22</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>Cl</b>	<b>C(S)NH<sub>2</sub></b>	<b>H</b>
<b>23</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>Br</b>	<b>C(S)NH<sub>2</sub></b>	<b>H</b>
<b>24</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>	<b>C(S)NH<sub>2</sub></b>	<b>H</b>
<b>25</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>C(S)NH<sub>2</sub></b>	<b>H</b>
<b>26</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>H</b>	<b>C(S)NH<sub>2</sub></b>	<b>H</b>
<b>27</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>Cl</b>	<b>C(S)NH<sub>2</sub></b>	<b>H</b>

[0486]

28	CF <sub>2</sub> Cl	Br	C(S)NH <sub>2</sub>	H
29	CF <sub>2</sub> Cl	F	C(S)NH <sub>2</sub>	H
30	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	C(S)NH <sub>2</sub>	H
31	CF <sub>3</sub>	H	CN	CH <sub>2</sub> CN
32	CF <sub>3</sub>	Cl	CN	CH <sub>2</sub> CN
33	CF <sub>3</sub>	Br	CN	CH <sub>2</sub> CN
34	CF <sub>3</sub>	F	CN	CH <sub>2</sub> CN
35	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CN	CH <sub>2</sub> CN
36	CF <sub>2</sub> Cl	H	CN	CH <sub>2</sub> CN
37	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	CN	CH <sub>2</sub> CN
38	CF <sub>2</sub> Cl	Br	CN	CH <sub>2</sub> CN
39	CF <sub>2</sub> Cl	F	CN	CH <sub>2</sub> CN
40	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	CN	CH <sub>2</sub> CN
41	CF <sub>3</sub>	H	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
42	CF <sub>3</sub>	Cl	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
43	CF <sub>3</sub>	Br	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
44	CF <sub>3</sub>	F	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
45	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
46	CF <sub>2</sub> Cl	H	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
47	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
48	CF <sub>2</sub> Cl	Br	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
49	CF <sub>2</sub> Cl	F	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
50	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
51	CF <sub>3</sub>	H	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
52	CF <sub>3</sub>	Cl	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
53	CF <sub>3</sub>	Br	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
54	CF <sub>3</sub>	F	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
55	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
56	CF <sub>2</sub> Cl	H	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
57	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
58	CF <sub>2</sub> Cl	Br	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
59	CF <sub>2</sub> Cl	F	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
60	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN
61	CF <sub>3</sub>	H	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
62	CF <sub>3</sub>	Cl	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
63	CF <sub>3</sub>	Br	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
64	CF <sub>3</sub>	F	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
65	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
66	CF <sub>2</sub> Cl	H	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>

[0487]

67	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
68	CF <sub>2</sub> Cl	Br	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
69	CF <sub>2</sub> Cl	F	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
70	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
71	CF <sub>3</sub>	H	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
72	CF <sub>3</sub>	Cl	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
73	CF <sub>3</sub>	Br	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
74	CF <sub>3</sub>	F	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
75	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
76	CF <sub>2</sub> Cl	H	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
77	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
78	CF <sub>2</sub> Cl	Br	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
79	CF <sub>2</sub> Cl	F	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
80	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
81	CF <sub>3</sub>	H	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
82	CF <sub>3</sub>	Cl	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
83	CF <sub>3</sub>	Br	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
84	CF <sub>3</sub>	F	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
85	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
86	CF <sub>2</sub> Cl	H	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
87	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
88	CF <sub>2</sub> Cl	Br	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
89	CF <sub>2</sub> Cl	F	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
90	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
91	CF <sub>3</sub>	H	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
92	CF <sub>3</sub>	Cl	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
93	CF <sub>3</sub>	Br	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
94	CF <sub>3</sub>	F	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
95	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
96	CF <sub>2</sub> Cl	H	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
97	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
98	CF <sub>2</sub> Cl	Br	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
99	CF <sub>2</sub> Cl	F	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
100	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	CN	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
101	CF <sub>3</sub>	H	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
10	CF <sub>3</sub>	Cl	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
103	CF <sub>3</sub>	Br	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
104	CF <sub>3</sub>	F	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
105	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

[0488]

106	CF <sub>2</sub> Cl	H	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
107	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
108	CF <sub>2</sub> Cl	Br	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
109	CF <sub>2</sub> Cl	F	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
110	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
111	CF <sub>3</sub>	H	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
112	CF <sub>3</sub>	Cl	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
113	CF <sub>3</sub>	Br	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
114	CF <sub>3</sub>	F	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
115	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
116	CF <sub>2</sub> Cl	H	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
117	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
118	CF <sub>2</sub> Cl	Br	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
119	CF <sub>2</sub> Cl	F	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
120	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
121	CF <sub>3</sub>	H	CN	C(O)OCH <sub>3</sub>
122	CF <sub>3</sub>	Cl	CN	C(O)OCH <sub>3</sub>
123	CF <sub>3</sub>	Br	CN	C(O)OCH <sub>3</sub>
124	CF <sub>3</sub>	F	CN	C(O)OCH <sub>3</sub>
125	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CN	C(O)OCH <sub>3</sub>
126	CF <sub>2</sub> Cl	H	CN	C(O)OCH <sub>3</sub>
127	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	CN	C(O)OCH <sub>3</sub>
128	CF <sub>2</sub> Cl	Br	CN	C(O)OCH <sub>3</sub>
129	CF <sub>2</sub> Cl	F	CN	C(O)OCH <sub>3</sub>
130	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	CN	C(O)OCH <sub>3</sub>
131	CF <sub>3</sub>	H	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
132	CF <sub>3</sub>	Cl	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
133	CF <sub>3</sub>	Br	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
134	CF <sub>3</sub>	F	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
135	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
136	CF <sub>2</sub> Cl	H	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
137	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
138	CF <sub>2</sub> Cl	Br	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
139	CF <sub>2</sub> Cl	F	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
140	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
141	CF <sub>3</sub>	H	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
142	CF <sub>3</sub>	Cl	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
143	CF <sub>3</sub>	Br	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
144	CF <sub>3</sub>	F	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>

[0489]

145	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
146	CF <sub>2</sub> Cl	H	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
147	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
148	CF <sub>2</sub> Cl	Br	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
149	CF <sub>2</sub> Cl	F	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
150	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>3</sub>
151	CF <sub>3</sub>	H	CN	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
152	CF <sub>3</sub>	Cl	CN	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
153	CF <sub>3</sub>	Br	CN	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
154	CF <sub>3</sub>	F	CN	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
155	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CN	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
156	CF <sub>2</sub> Cl	H	CN	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
157	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	CN	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
158	CF <sub>2</sub> Cl	Br	CN	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
159	CF <sub>2</sub> Cl	F	CN	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
160	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	CN	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
161	CF <sub>3</sub>	H	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
162	CF <sub>3</sub>	Cl	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
163	CF <sub>3</sub>	Br	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
164	CF <sub>3</sub>	F	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
165	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
166	CF <sub>2</sub> Cl	H	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
167	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
168	CF <sub>2</sub> Cl	Br	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
169	CF <sub>2</sub> Cl	F	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
170	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	C(O)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
171	CF <sub>3</sub>	H	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
172	CF <sub>3</sub>	Cl	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
173	CF <sub>3</sub>	Br	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
174	CF <sub>3</sub>	F	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
175	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
176	CF <sub>2</sub> Cl	H	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
177	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
178	CF <sub>2</sub> Cl	Br	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
179	CF <sub>2</sub> Cl	F	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
180	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	C(S)NH <sub>2</sub>	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
181	CF <sub>3</sub>	H	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
182	CF <sub>3</sub>	Cl	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
183	CF <sub>3</sub>	Br	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>



[0490]

184	CF <sub>3</sub>	F	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
185	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
186	CF <sub>2</sub> Cl	H	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
187	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
188	CF <sub>2</sub> Cl	Br	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
189	CF <sub>2</sub> Cl	F	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
190	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
191	CF <sub>3</sub>	H	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
192	CF <sub>3</sub>	Cl	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
193	CF <sub>3</sub>	Br	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
194	CF <sub>3</sub>	F	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
195	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
196	CF <sub>2</sub> Cl	H	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
197	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
198	CF <sub>2</sub> Cl	Br	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
199	CF <sub>2</sub> Cl	F	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
200	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
201	CF <sub>3</sub>	H	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
202	CF <sub>3</sub>	Cl	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
203	CF <sub>3</sub>	Br	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
204	CF <sub>3</sub>	F	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
205	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
206	CF <sub>2</sub> Cl	H	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
207	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
208	CF <sub>2</sub> Cl	Br	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
209	CF <sub>2</sub> Cl	F	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
210	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>
211	CF <sub>3</sub>	H	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
212	CF <sub>3</sub>	Cl	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
213	CF <sub>3</sub>	Br	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
214	CF <sub>3</sub>	F	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
215	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
216	CF <sub>2</sub> Cl	H	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
217	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
218	CF <sub>2</sub> Cl	Br	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
219	CF <sub>2</sub> Cl	F	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
220	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
221	CF <sub>3</sub>	H	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
222	CF <sub>3</sub>	Cl	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>

[0491]

223	CF <sub>3</sub>	Br	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
224	CF <sub>3</sub>	F	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
225	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
226	CF <sub>2</sub> Cl	H	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
227	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
228	CF <sub>2</sub> Cl	Br	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
229	CF <sub>2</sub> Cl	F	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
230	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
231	CF <sub>3</sub>	H	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
232	CF <sub>3</sub>	Cl	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
233	CF <sub>3</sub>	Br	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
234	CF <sub>3</sub>	F	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
235	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
236	CF <sub>2</sub> Cl	H	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
237	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
238	CF <sub>2</sub> Cl	Br	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
239	CF <sub>2</sub> Cl	F	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
240	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
241	CF <sub>3</sub>	H	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
242	CF <sub>3</sub>	Cl	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
243	CF <sub>3</sub>	Br	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
244	CF <sub>3</sub>	F	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
245	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
246	CF <sub>2</sub> Cl	H	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
247	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
248	CF <sub>2</sub> Cl	Br	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
249	CF <sub>2</sub> Cl	F	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
250	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	CN	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
251	CF <sub>3</sub>	H	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
252	CF <sub>3</sub>	Cl	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
253	CF <sub>3</sub>	Br	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
254	CF <sub>3</sub>	F	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
255	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
256	CF <sub>2</sub> Cl	H	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
257	CF <sub>2</sub> Cl	Cl	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
258	CF <sub>2</sub> Cl	Br	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
259	CF <sub>2</sub> Cl	F	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
260	CF <sub>2</sub> Cl	CF <sub>3</sub>	C(O)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
261	CF <sub>3</sub>	H	C(S)NH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> OC(O)C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>

[0492]	<b>262</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>Cl</b>	<b>C(S)NH<sub>2</sub></b>	<b>CH<sub>2</sub>OC(O)C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub></b>
	<b>263</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>Br</b>	<b>C(S)NH<sub>2</sub></b>	<b>CH<sub>2</sub>OC(O)C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub></b>
	<b>264</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>F</b>	<b>C(S)NH<sub>2</sub></b>	<b>CH<sub>2</sub>OC(O)C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub></b>
	<b>265</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>C(S)NH<sub>2</sub></b>	<b>CH<sub>2</sub>OC(O)C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub></b>
	<b>266</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>H</b>	<b>C(S)NH<sub>2</sub></b>	<b>CH<sub>2</sub>OC(O)C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub></b>
	<b>267</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>Cl</b>	<b>C(S)NH<sub>2</sub></b>	<b>CH<sub>2</sub>OC(O)C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub></b>
	<b>268</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>Br</b>	<b>C(S)NH<sub>2</sub></b>	<b>CH<sub>2</sub>OC(O)C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub></b>
	<b>269</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>F</b>	<b>C(S)NH<sub>2</sub></b>	<b>CH<sub>2</sub>OC(O)C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub></b>
	<b>270</b>	<b>CF<sub>2</sub>Cl</b>	<b>CF<sub>3</sub></b>	<b>C(S)NH<sub>2</sub></b>	<b>CH<sub>2</sub>OC(O)C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub></b>

[0493] 表B-1提供了270种具有式 (Id) 的化合物B-1.001至B-1.270, 其中X<sub>2</sub>是N, X<sub>1</sub>是H, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0494] 表B-2提供了270种具有式 (Id) 的化合物B-2.001至B-2.270, 其中X<sub>2</sub>是N, X<sub>1</sub>是Cl, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0495] 表B-3提供了270种具有式 (Id) 的化合物B-3.001至B-3.270, 其中X<sub>2</sub>是N, X<sub>1</sub>是Br, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0496] 表B-4提供了270种具有式 (Id) 的化合物B-4.001至B-4.270, 其中X<sub>2</sub>是N, X<sub>1</sub>是F, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0497] 表B-5提供了270种化合物B-5.001至B-5.270种式 (Id), 其中X<sub>2</sub>是N, X<sub>1</sub>是CF<sub>3</sub>, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0498] 表B-6提供了270种化合物B-6.001至B-6.270种式 (Id), 其中X<sub>2</sub>是C-H, X<sub>1</sub>是H, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0499] 表B-7提供了270种化合物B-7.001至B-7.270种式 (Id), 其中X<sub>2</sub>是C-H, X<sub>1</sub>是Cl, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0500] 表B-8提供了270种化合物B-8.001至B-8.270种式 (Id), 其中X<sub>2</sub>是C-H, X<sub>1</sub>是Br, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0501] 表B-9提供了270种化合物B-9.001至B-9.270种式 (Id), 其中X<sub>2</sub>是C-H, X<sub>1</sub>是F, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0502] 表B-10提供了270种化合物B-10.001至B-10.270种式 (Id), 其中X<sub>2</sub>是C-H, X<sub>1</sub>是CF<sub>3</sub>, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0503] 表B-11提供了270种化合物B-11.001至B-11.270种式 (Id), 其中X<sub>2</sub>是C-Cl, X<sub>1</sub>是H, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0504] 表B-12提供了270种化合物B-12.001至B-12.270种式 (Id), 其中X<sub>2</sub>是C-Cl, X<sub>1</sub>是Cl, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0505] 表B-13提供了270种化合物B-13.001至B-13.270种式 (Id), 其中X<sub>2</sub>是C-Cl, X<sub>1</sub>是Br, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0506] 表B-14提供了270种化合物B-14.001至B-14.270种式 (Id), 其中X<sub>2</sub>是C-Cl, X<sub>1</sub>是F, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0507] 表B-15提供了270种化合物B-15.001至B-15.270种式 (Id), 其中X<sub>2</sub>是C-Cl, X<sub>1</sub>是CF<sub>3</sub>, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0508] 表B-16提供了270种化合物B-16.001至B-16.270种式(Id),其中X2是C-Br,X1是H,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0509] 表B-17提供了270种化合物B-17.001至B-17.270种式(Id),其中X2是C-Br,X1是Cl,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0510] 表B-18提供了270种化合物B-18.001至B-18.270种式(Id),其中X2是C-Br,X1是Br,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0511] 表B-19提供了270种化合物B-19.001至B-19.270种式(Id),其中X2是C-Br,X1是F,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0512] 表B-20提供了270种化合物B-20.001至B-20.270种式(Id),其中X2是C-Br,X1是CF<sub>3</sub>,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0513] 表B-21提供了270种化合物B-21.001至B-21.270种式(Id),其中X2是C-F,X1是H,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0514] 表B-22提供了270种化合物B-22.001至B-22.270种式(Id),其中X2是C-F,X1是Cl,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0515] 表B-23提供了270种化合物B-23.001至B-23.270种式(Id),其中X2是C-F,X1是Br,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0516] 表B-24提供了270种化合物B-24.001至B-24.270种式(Id),其中X2是C-F,X1是F,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0517] 表B-25提供了270种化合物B-25.001至B-25.270种式(Id),其中X2是C-F,X1是CF<sub>3</sub>,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0518] 表B-26提供了270种化合物B-26.001至B-26.270种式(Id),其中X2是C-CF<sub>3</sub>,X1是H,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

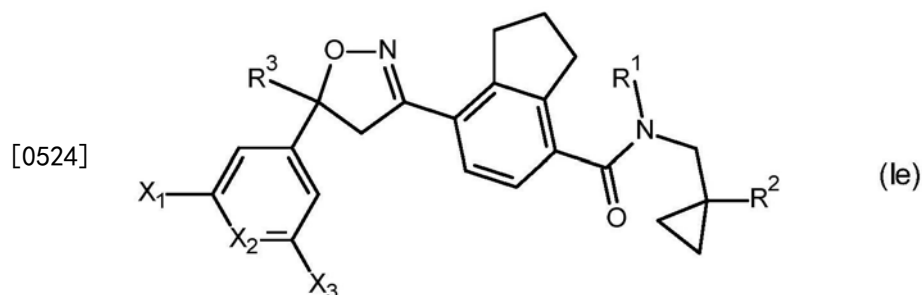
[0519] 表B-27提供了270种化合物B-27.001至B-27.270种式(Id),其中X2是C-CF<sub>3</sub>,X1是Cl,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0520] 表B-28提供了270种化合物B-28.001至B-28.270种式(Id),其中X2是C-CF<sub>3</sub>,X1是Br,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0521] 表B-29提供了270种化合物B-29.001至B-29.270种式(Id),其中X2是C-CF<sub>3</sub>,X1是F,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0522] 表B-30提供了270种化合物B-30.001至B-30.270种式(Id),其中X2是C-CF<sub>3</sub>,X1是CF<sub>3</sub>,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0523] 通过使以下在表C-1至C-270中列出的具有式(Ie)的个体化合物可得,对本发明做了进一步地说明。



[0525] 表C-1提供了270种化合物C-1.001至C-1.270种式(Ie),其中X2是N,X1是H,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0526] 表C-2提供了270种化合物C-2.001至C-2.270种式(Ie),其中X2是N,X1是Cl,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0527] 表C-3提供了270种化合物C-3.001至C-3.270种式(Ie),其中X2是N,X1是Br,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0528] 表C-4提供了270种化合物C-4.001至C-4.270种式(Ie),其中X2是N,X1是F,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0529] 表C-5提供了270种化合物C-5.001至C-5.270种式(Ie),其中X2是N,X1是CF<sub>3</sub>,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0530] 表C-6提供了270种化合物C-6.001至C-6.270种式(Ie),其中X2是C-H,X1是H,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0531] 表C-7提供了270种化合物C-7.001至C-7.270种式(Ie),其中X2是C-H,X1是Cl,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0532] 表C-8提供了270种化合物C-8.001至C-8.270种式(Ie),其中X2是C-H,X1是Br,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0533] 表C-9提供了270种化合物C-9.001至C-9.270种式(Ie),其中X2是C-H,X1是F,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0534] 表C-10提供了270种化合物C-10.001至C-10.270种式(Ie),其中X2是C-H,X1是CF<sub>3</sub>,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0535] 表C-11提供了270种化合物C-11.001至C-11.270种式(Ie),其中X2是C-Cl,X1是H,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0536] 表C-12提供了270种化合物C-12.001至C-12.270种式(Ie),其中X2是C-Cl,X1是Cl,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0537] 表C-13提供了270种化合物C-13.001至C-13.270种式(Ie),其中X2是C-Cl,X1是Br,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0538] 表C-14提供了270种化合物C-14.001至C-14.270种式(Ie),其中X2是C-Cl,X1是F,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0539] 表C-15提供了270种化合物C-15.001至C-15.270种式(Ie),其中X2是C-Cl,X1是CF<sub>3</sub>,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0540] 表C-16提供了270种化合物C-16.001至C-16.270种式(Ie),其中X2是C-Br,X1是H,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0541] 表C-17提供了270种化合物C-17.001至C-17.270种式(Ie),其中X2是C-Br,X1是Cl,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0542] 表C-18提供了270种化合物C-18.001至C-18.270种式(Ie),其中X2是C-Br,X1是Br,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0543] 表C-19提供了270种化合物C-19.001至C-19.270种式(Ie),其中X2是C-Br,X1是F,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0544] 表C-20提供了270种化合物C-20.001至C-20.270种式(Ie),其中X2是C-Br,X1是

CF<sub>3</sub>, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0545] 表C-21提供了270种化合物C-21.001至C-21.270种式(Ie), 其中X<sub>2</sub>是C-F, X<sub>1</sub>是H, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0546] 表C-22提供了270种化合物C-22.001至C-22.270种式(Ie), 其中X<sub>2</sub>是C-F, X<sub>1</sub>是Cl, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0547] 表C-23提供了270种化合物C-23.001至C-23.270种式(Ie), 其中X<sub>2</sub>是C-F, X<sub>1</sub>是Br, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0548] 表C-24提供了270种化合物C-24.001至C-24.270种式(Ie), 其中X<sub>2</sub>是C-F, X<sub>1</sub>是F, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0549] 表C-25提供了270种化合物C-25.001至C-25.270种式(Ie), 其中X<sub>2</sub>是C-F, X<sub>1</sub>是CF<sub>3</sub>, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0550] 表C-26提供了270种化合物C-26.001至C-26.270种式(Ie), 其中X<sub>2</sub>是C-CF<sub>3</sub>, X<sub>1</sub>是H, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0551] 表C-27提供了270种化合物C-27.001至C-27.270种式(Ie), 其中X<sub>2</sub>是C-CF<sub>3</sub>, X<sub>1</sub>是Cl, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0552] 表C-28提供了270种化合物C-28.001至C-28.270种式(Ie), 其中X<sub>2</sub>是C-CF<sub>3</sub>, X<sub>1</sub>是Br, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0553] 表C-29提供了270种化合物C-29.001至C-29.270种式(Ie), 其中X<sub>2</sub>是C-CF<sub>3</sub>, X<sub>1</sub>是F, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0554] 表C-30提供了270种化合物C-30.001至C-30.270种式(Ie), 其中X<sub>2</sub>是C-CF<sub>3</sub>, X<sub>1</sub>是CF<sub>3</sub>, 并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>和X<sub>3</sub>是如在表P1中所定义的。

[0555] 根据本发明的具有式(I)的化合物在有害生物控制领域中是有预防和/或治疗价值的活性成分, 即使是在低的施用量下, 它们具有非常有利的杀生物谱并且是温血物种、鱼以及植物良好耐受的。根据本发明的这些活性成分作用于正常敏感的以及还有抗药的动物有害生物(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示, 亦即或者立即或者仅在过去一些时间之后(例如在蜕皮期间)发生破坏有害生物; 或间接显示, 例如降低产卵和/或孵化率。

[0556] 上述动物有害生物的实例是:

[0557] 来自蜱螨目, 例如

[0558] 下毛瘿螨属(*Acalitus* spp.)、针刺瘿螨属(*Aculus* spp.)、窄瘿螨属(*Acaricalus* spp.)、瘤瘿螨属(*Aceria* spp.)、粗脚粉螨(*Acarus siro*)、钝眼蜱属(*Amblyomma* spp.)、锐缘蜱属(*Argas* spp.)、牛蜱属(*Boophilus* spp.)、短须螨属(*Brevipalpus* spp.)、苔螨属(*Bryobia* spp.)、上三节瘿螨属(*Calipitimerus* spp.)、皮螨属(*Chorioptes* spp.)、鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*)、表皮螨属(*Dermatophagoides* spp.)、始叶螨属(*Eotetranychus* spp.)、瘿螨属(*Eriophyes* spp.)、半跗线螨属(*Hemitarsonemus* spp.)、璃眼蜱属(*Hyalomma* spp.)、硬蜱属(*Ixodes* spp.)、小爪螨属(*Olygonychus* spp.)、钝缘蜱属(*Ornithodoros* spp.)、侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonus latus*)、全爪螨属(*Panonychus* spp.)、桔芸锈螨(*Phyllocoptruta oleivora*)、植食螨(*Phytonemus* spp.)、跗线螨属(*Polyphagotarsonemus* spp.)、痒螨属(*Psoroptes* spp.)、扇头蜱属(*Rhipicephalus*

spp.)、根嗜螨属(*Rhizoglyphus* spp.)、疥螨属(*Sarcoptes* spp.)、狭跗线螨属(*Steneotarsonemus* spp.)、跗线属(*Tarsonemus* spp.)以及叶螨属(*Tetranychus* spp.)；

[0559] 来自虱目,例如

[0560] 血虱属(*Haematopinus* spp.)、长颚虱属(*Linognathus* spp.)、人虱(*Pediculus* spp.)、天庖疮属(*Pemphigus* spp.)以及木虱(*Phylloxera* spp.)；

[0561] 来自鞘翅目,例如

[0562] 缺隆叩甲属(*Agriotes* spp.)、欧洲鳃角金龟(*Amphimallon majale*)、东方异丽金龟(*Anomala orientalis*)、花象属(*Anthonomus* spp.)、蜉金龟属(*Aphodius* spp.)、玉米拟花萤(*Astylus atromaculatus*)、*Ataenius*属、甜菜隐食甲(*Atomaria linearis*)、甜菜胫跳甲(*Chaetocnema tibialis*)、萤叶甲属(*Cerotoma* spp.)、单叶叩甲属(*Conoderus* spp.)、根颈象属(*Cosmopolites* spp.)、绿金龟(*Cotinisnitida*)、象虫属(*Curculio* spp.)、圆头犀金龟属(*Cyclocephala* spp.)、圆头犀金龟属(*Dermestes* spp.)、根萤叶甲属(*Diabrotica* spp.)、阿根廷兜虫(*Diloboderus abderus*)、食植瓢虫属(*Epilachna* spp.)、*Eremnus*属、黑异爪蔗金龟(*Heteronychus arator*)、咖啡果小蠹(*Hypothenemus hampei*)、*Lagria vilosa*、马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata*)、稻水象属(*Lissorhoptrus* spp.)、*Liogenys*属、*Maecolaspis*属、栗色绒金龟(*Maladera castanea*)、美洲叶甲亚种(*Megascelis* spp.)、油菜花露尾甲(*Melighetes aeneus*)、金龟属(*Melolontha* spp.)、*Myochrous armatus*、锯谷盗属(*Oryzaephilus* spp.)、耳喙象属(*Otiorhynchus* spp.)、鳃角金龟属(*Phyllophaga* spp.)、斑象属(*Phlyctinus* spp.)、丽金龟属(*Popillia* spp.)、油菜跳甲属(*Psylliodes* spp.)、*Rhyssomatus aubtilis*、劫根蠹属(*Rhizopertha* spp.)、金龟子科(*Scarabeidae*)、米象属(*Sitophilus* spp.)、麦蛾属(*Sitotroga* spp.)、伪切根虫属(*Somaticus* spp.)、*Sphenophorus*属、大豆茎象(*Sternechus subsignatus*)、拟步行虫属(*Tenebrio* spp.)、拟谷盗属(*Tribolium* spp.)以及斑皮蠹属(*Trogoderma* spp.)；

[0563] 来自双翅目,例如

[0564] 伊蚊属(*Aedes* spp.)、疟蚊属(*Anopheles* spp.)、高粱芒蝇(*Antherigona soccata*)、橄榄果实蝇(*Bactrocea oleae*)、花园毛蚊(*Bibio hortulanus*)、迟眼蕈蚊属(*Bradysia* spp.)、红头丽蝇(*Calliphora erythrocephala*)、小条实蝇属(*Ceratitis* spp.)、金蝇属(*Chrysomya* spp.)、库蚊属(*Culex* spp.)、黄蝇属(*Cuterebra* spp.)、寡鬃实蝇属(*Dacus* spp.)、地种蝇属(*Delia* spp.)、黑腹果蝇(*Drosophilamelanogaster*)、厕蝇属(*Fannia* spp.)、胃蝇属(*Gastrophilus* spp.)、*Geomyza tripunctata*、舌蝇属(*Glossina* spp.)、皮蝇属(*Hypoderma* spp.)、虱蝇属(*Hyppobosca* spp.)、斑潜蝇属(*Liriomyza* spp.)、绿蝇属(*Lucilia* spp.)、潜蝇属(*Melanagromyza* spp.)、家蝇属(*Musca* spp.)、狂蝇属(*Oestrus* spp.)、癭蚊属(*Orseolia* spp.)、瑞典麦秆蝇(*Oscinella frit*)、藜泉蝇(*Pegomyia hyoscyami*)、草种蝇属(*Phorbia* spp.)、绕实蝇属(*Rhagoletis* spp.)、*Rivelia quadrifasciata*、*Scatella*属、蕈蚊属(*Sciara* spp.)、刺蝇属(*Stomoxys* spp.)、虻属(*Tabanus* spp.)、绦虫属(*Tannia* spp.)以及大蚊属(*Tipula* spp.)；

[0565] 来自半翅目(*Hemiptera*) ,例如

[0566] 瘤缘蝽(*Acanthocoris scabrator*)、绿蝽属、苜蓿盲蝽、*Amblypeltanitida*、海虾盾缘蝽(*Bathycoelia thalassina*)、土长蝽属、臭虫属、*Clavigralla tomentosicollis*、盲

蝽属(*Creontiades* spp.)、可可瘤盲蝽、*Dichelops furcatus*、棉红蝽属、*Edessa*属、美洲蝽属(*Euchistus* spp.)、六斑菜蝽(*Eurydema pulchrum*)、扁盾蝽属、茶翅蝽、具凹巨股长蝽(*Horciasnobilellus*)、稻缘蝽属、草盲蝽属、热带硕蚱属、卷心菜斑色蝽(*Murgantia histrionic*)、*Neomegalotomus*属、烟盲蝽(*Nesidiocoris tenuis*)、绿蝽属、拟长蝽(*Nysius simulans*)、*Oebalus insularis*、皮蝽属、壁蝽属、红猎蝽属、可可盲蝽象、*Scaptocoris castanea*、黑蝽属(*Scotinophara* spp.)、*Thyanta*属、锥鼻虫属、木薯网蝽(*Vatiga illudens*)；无网长管蚜属、*Adalges* spp.、*Agalliana ensigera*、*Agonosцена targionii*、粉虱属(*Aleurodicus* spp.)、*Aleurocanthus* spp.、甘蔗穴粉虱、软毛粉虱(*Aleurothrixus floccosus*)、甘蓝粉虱(*Aleyrodes brassicae*)、棉叶蝉(*Amarasca biguttula*)、*Amritodus atkinson*、肾圆盾蚱属、蚜科、蚜属、蚱属(*Aspidiotus* spp.)、茄沟无网蚜、*Bactericera cockerelli*、小粉虱属、*Brachycaudus* spp.、甘蓝蚜、喀木虱属、双尾蚜(*Cavariella aegopodii* Scop.)、蜡蚱属、褐圆蚱、网籽草叶圆蚱、*Cicadella* spp.、大白叶蝉(*Cofana spectra*)、隐瘤蚜属、*Cicadulina* spp.、褐软蚱、玉米黄翅叶蝉、裸粉虱属、柑橘木虱、麦双尾蚜、西圆尾蚜属、小绿叶蝉属、苹果绵蚜、葡萄斑叶蝉属、蜡蛤属、赤桉木虱(*Glycaspis brimblecombei*)、菜缢管蚜、*Hyalopterus* spp.、超瘤蚜种、檬果绿叶蝉(*Idioscopus clypealis*)、*Jacobiasca lybica*、灰飞虱属、球坚蚱、蛎盾蚱属、萝卜蚜(*Lopaphis erysimi*)、*Lyogenys maidis*、长管蚜属、*Mahanarva* spp.、蛾蜡蝉科(*Metcalfa pruinosa*)、麦无网蚜、*Myndus crudus*、瘤蚜属、台湾韭蚜、黑尾叶蝉属、褐飞虱属(*Nilaparvata* spp.)、梨大绿蚜、*Odonaspis ruthae*、寄生甘蔗绵蚜、杨梅缘粉虱、考氏木虱、片盾蚱属、瘿绵蚜属、玉米蜡蝉、扁角飞虱属、忽布疣蚜、根瘤蚜属、动性球菌属、白盾蚱属、粉蚱属、棉盲蝽(*Pseudatomoscelis seriatus*)、木虱属、棉蚱(*Pulvinaria aethiopica*)、笠圆盾蚱属、*Quesada gigas*、电光叶蝉(*Recilia dorsalis*)、缢管蚜属、黑盔蚱属、带叶蝉属、二叉蚜属、麦蚜属(*Sitobion* spp.)、白背飞虱、*Spissistilus festinus*、条斑飞虱(*Tarophagus Proserpina*)、声蚜属、粉虱属、*Tridiscus sporoboli*、葵粉蚱属(*Trionymus* spp.)、非洲木虱、桔矢尖蚱、*Zygina flammigera*、*Zyginidia scutellaris*；

[0567] 来自膜翅目，例如

[0568] 顶切叶蚁属(*Acromyrmex*)、三节叶蜂属(*Arge* spp.)、布切叶白蚁属(*Atta* spp.)、茎叶蜂属(*Cephus* spp.)、松叶蜂属(*Diprion* spp.)、锯角叶蜂科(*Diprionidae*)、松叶蜂(*Gilpinia polytoma*)、梨实蜂属(*Hoplocampa* spp.)、毛蚁属(*Lasius* spp.)、小黄家蚁(*Monomorium pharaonis*)、新松叶蜂属(*Neodiprion* spp.)、农蚁属(*Pogonomyrmex* spp.)、*Slenopsis invicta*、水蚁属(*Solenopsis* spp.)以及胡蜂属(*Vespa* spp.)；

[0569] 来自等翅目，例如

[0570] 家白蚁属、白蚁(*Cornitermes cumulans*)、楹白蚁属、大白蚁属、澳白蚁属、小白蚁属、散白蚁属；热带火蚁

[0571] 来自鳞翅目，例如

[0572] 长翅卷蛾属、褐带卷蛾属、透翅蛾属、地夜蛾属、棉叶虫、*Amylois* spp.、黎豆夜蛾、黄卷蛾属、银蛾属(*Argyresthia* spp.)、带卷蛾属、丫纹夜蛾属、棉潜蛾、玉米楷夜蛾、粉斑螟蛾、桃蛀果蛾、禾草螟属、卷叶蛾属、越蔓桔草螟(*Chrysoteuchia topiaria*)、葡萄果蠹蛾、卷叶螟属、云卷蛾属、纹卷蛾属、鞘蛾属、磷翅目粉蝶、*Cosmophila flava*、草螟属、大菜



螟、苹果异形小卷蛾、黄杨木蛾、小卷蛾属、黄杨绢野螟、杆草螟属、苏丹棉铃虫、金刚钻属、非洲茎螟、粉螟属、叶小卷蛾属(*Epinotia* spp.)、细斑灯蛾、*Etiella zinckinella*、花小卷蛾属、环针单纹蛾、黄毒蛾属、切根虫属、*Feltia jaculifera*、*Grapholita* spp.、绿青虫蛾、实夜蛾属、菜螟、切叶野螟属(*Herpetogramma* spp.)、美国白蛾、番茄蠹蛾、*Lasmopalpus lignosellus*、旋纹潜叶蛾、潜叶细蛾属、葡萄花翅小卷蛾、*Loxostege bifidalis*、毒蛾属、潜蛾属、幕枯叶蛾属、甘蓝夜蛾、烟草天蛾、*Mythimna* spp.、夜蛾属、秋尺蛾属、*Orniodes indica*、欧洲玉米螟、超小卷蛾属、褐卷蛾属、小眼夜蛾、蛀茎夜蛾、*Pectinophora gossypiella*、咖啡潜叶蛾、一星黏虫、马铃薯麦蛾、菜粉蝶、粉蝶属、小菜蛾、芽蛾属、尺叶蛾属、薄荷灰夜蛾、西方豆地香(*Richia albicosta*)、白禾螟属(*Scirpophaga* spp.)、蛀茎夜蛾属、长须卷蛾属、灰翅夜蛾属、棉大卷叶螟、兴透翅蛾属、异舟蛾属、卷叶蛾属、粉纹夜蛾、番茄斑潜蝇、以及巢蛾属；

[0573] 来自食毛目，例如

[0574] 畜虱属(*Damalinea* spp.)和啮毛虱属(*Trichodectes* spp.)；

[0575] 来自直翅目，例如

[0576] 蠊属、小蠊属、蝼蛄属、马德拉蜚蠊、飞蝗属、北痣蟋蟀(*Neocurtilla hexadactyla*)、大蠊属、痣蟋蟀属(*Scapteriscus* spp.)、以及沙漠蝗属；

[0577] 来自啮虫目，例如

[0578] 虱啮属(*Liposcelis* spp.)；

[0579] 来自蚤目，例如

[0580] 角叶蚤属(*Ceratophyllus* spp.)、栉头蚤属(*Ctenocephalides* spp.)以及开皇客蚤(*Xenopsylla cheopis*)；

[0581] 来自缨翅目，例如

[0582] *Calliothrips phaseoli*、花蓟马属、阳蓟马属、褐带蓟马属、单亲蓟马属(*Parthenothrips* spp.)、非洲桔硬蓟马(*Scirtothrips aurantii*)、大豆蓟马(*Sericothrips variabilis*)、带蓟马属、蓟马属；

[0583] 来自缨尾目，例如衣鱼(*Lepisma saccharina*)。

[0584] 根据本发明的活性成分可用于控制、也就是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抵抗这些有害生物。

[0585] 适宜的目标作物具体是，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。

[0586] 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。

[0587] 例如,本发明可以用在任何以下观赏植物物种上:藿香蓟属、假面花属(*Alonsoa* spp.)、银莲花属、南非葵、春黄菊属、金鱼草属、紫菀属、秋海棠属(例如丽格海棠、四季秋海棠、球根秋海棠(*B. tubéreux*))、叶子花属、雁河菊属(*Brachycome* spp.)、芸苔属(观赏植物)、蒲包草属、辣椒、长春花、美人蕉属、矢车菊属、菊属、瓜叶菊属(银叶菊)、金鸡菊属、青锁龙(*Crassula coccinea*)、火红萼距花(*Cuphea ignea*)、大丽花属、翠雀属、荷包牡丹、彩虹菊属(*Dorotheantus* spp.)、洋桔梗、连翘属、倒挂金钟属、鼠曲草老鹳草(*Geranium gnaphalium*)、大丁草属、千日红、天芥菜属、向日葵属、木槿属、绣球花属、绣球属、嫣红蔓、凤仙花属(非洲凤仙花)、血苋属(*Iresines* spp.)、伽蓝菜属、马缨丹、三月花葵、狮耳花、百合属、日中花属、沟酸浆属、美国薄荷属、龙面花属、万寿菊属、石竹属(康乃馨)、美人蕉属、酢浆草属、雏菊属、天竺葵属(盾叶天竺葵、马蹄纹天竺葵)、堇菜属(三色堇)、碧冬茄属、草夹竹桃属、香茶菜属(*Plecthranthus* spp.)、一品红属、爬山虎属(五叶爬山虎、爬山虎)、报春花属、毛茛属、杜鹃花属、蔷薇属(玫瑰)、黄雏菊属、非洲堇属、鼠尾草属、紫扇花(*Scaevola aemola*)、蛾蝶花(*Schizanthus wisetonensis*)、景天属、茄属、苏非尼亚矮牵牛属(*Surfinia* spp.)、万寿菊属、烟草属、马鞭草属、百日草属以及其他花坛植物。

[0588] 例如,本发明可以用在任何以下蔬菜物种上:葱属(大蒜、洋葱、火葱(*A. oschaninii*))、韭葱、小葱、大葱)、有喙欧芹、旱芹、芦笋、甜菜、芸苔属(甘蓝、大白菜、芜菁)、辣椒、鹰嘴豆、苦苣、菊苣属(菊苣、苦苣)、西瓜、黄瓜属(黄瓜、甜瓜)、南瓜属(西葫芦、印度南瓜)、菜蓟属(朝鲜蓟、刺苞菜蓟)、胡萝卜、茴香、金丝桃属、莴苣、番茄属(番茄、樱桃番茄)、薄荷属、罗勒、香芹、菜豆属(菜豆、荷包豆)、豌豆、萝卜、食用大黄、迷迭香属、鼠尾草属、黑婆罗门参、茄子、菠菜、新缬草属(莴苣缬草、*V. eriocarpa*)以及蚕豆。

[0589] 优选的观赏植物物种包括非洲堇、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、薄荷、甜椒、番茄和黄瓜。

[0590] 根据本发明所述的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(优选地在马铃薯上)以及二化螟(优选地在水稻上)。

[0591] 在另一个方面,本发明还可以涉及控制由植物寄生的线虫(内寄生的-、半内寄生的-以及外寄生的线虫)对植物或其部分引起损害的方法,尤其是以下植物寄生的线虫,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种类(*Meloidogyne species*);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种类(*Globodera species*);禾谷孢囊线虫(*Heterodera avenae*)、大豆孢囊线虫(*Heterodera glycines*)、甜菜孢囊线虫(*Heterodera schachtii*)、红三叶异皮线虫(*Heterodera trifolii*)、以及其他异皮线虫属种类(*Heterodera species*);种瘿线虫(Seed gall nematodes)、粒线虫属种类(*Anguina species*);茎及叶面线虫(Stem and

foliar nematodes)、滑刃线虫属种类(*Aphelenchoides species*);刺毛线虫(*Sting nematodes*)、长尾刺线虫(*Belonolaimus longicaudatus*)以及其他刺线虫属种类;松树线虫(*Pine nematodes*)、松材线虫(*Bursaphelenchus xylophilus*)以及其他伞滑刃属种类(*Bursaphelenchus species*);环形线虫(*Ring nematodes*)、环线虫属种类(*Criconema species*)、小环线虫属种类(*Criconemella species*)、轮线虫属种类(*Criconemoides species*)、中环线虫属种类(*Mesocriconema species*);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*)以及其他茎线虫属种类(*Ditylenchus species*);锥线虫(*Awl nematodes*)、锥线虫属种类(*Dolichodorus species*);螺旋线虫(*Spiral nematodes*)、多头螺旋线虫(*Helicotylenchus multicinctus*)以及其他螺旋线虫属种类(*Helicotylenchus species*);鞘及鞘形线虫(*Sheath and sheathoid nematodes*)、鞘线虫属种类(*Hemicycliophora species*)以及半轮线虫属种类(*Hemicriconemoides species*);潜根线虫属种类(*Hirshmanniella species*);支线虫(*Lance nematodes*)、冠线虫属种类(*Hoploaimus species*);假根结线虫(*false rootknot nematodes*)、珍珠线虫属种类(*Nacobbus species*);针状线虫(*Needle nematodes*)、横带长针线虫(*Longidorus elongatus*)以及其他长针线虫属种类(*Longidorus species*);大头针线虫(*Pin nematodes*)、短体线虫属种类(*Pratylenchus species*);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种类(*Pratylenchus species*);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种类(*Radopholus species*);肾形线虫(*Reniform nematodes*)、罗柏氏盘旋线虫(*Rotylenchus robustus*)、肾形盘旋线虫(*Rotylenchus reniformis*)以及其他盘旋线虫属种类(*Rotylenchus species*);盾线虫属种类(*Scutellonema species*);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种类(*Trichodorus species*)、拟毛刺线虫属种类(*Paratrichodorus species*);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种类(*Tylenchorhynchus species*);柑桔线虫(*Citrus nematodes*)、穿刺线虫属种类(*Tylenchulus species*);短剑线虫(*Dagger nematodes*)、剑线虫属种类(*Xiphinema species*);以及其他植物寄生的线虫种类,如亚粒线虫属(*Subanguina spp.*)、*Hypsoperine*属、大刺环线虫属(*Macroposthonia spp.*)、*Melinius*属、刻点胞囊属(*Punctodera spp.*)、以及五沟线虫属(*Quinisulcius spp.*)。

[0592] 本发明所述的化合物还具有针对软体动物的活性。这些软体动物的实例包括例如苹果螺科;阿勇蛞蝓属(*Arion*) (灰黑阿勇蛞蝓(*A. ater*)、环斑阿勇蛞蝓(*A. circumscriptus*)、庭院阿勇蛞蝓(*A. hortensis*)、红棕阿勇蛞蝓(*A. rufus*));巴蜗牛科(灌木巴蜗牛(*Bradybaena fruticum*));蜗牛属(庭院蜗牛(*C. hortensis*)、森林蜗牛(*C. Nemoralis*));*ochlodina*;灰蛞蝓属(*Deroceras*) (野灰蛞蝓(*D. agrestis*)、*D. empiricorum*、田灰蛞蝓(*D. laeve*)、庭园灰蛞蝓(*D. reticulatum*));圆盘螺属(*Discus*) (*D. rotundatus*);*Euomphalia*;土蜗属(*Galba*) (截形土蜗(*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(*Helicigona arbustorum*);*Helicodiscus*;大蜗牛属(*Helix*) (开放大蜗牛 (*H.aperta*));蛞蝓属(*Limax*) (灰黑蛞蝓 (*L.cinereoniger*)、黄蛞蝓 (*L.flavus*)、边缘蛞蝓 (*L.marginatus*)、大蛞蝓 (*L.maximus*)、柔蛞蝓 (*L.tenellus*));椎实螺属(*Lymnaea*);*Milax* (*M.gagates*、*M.marginatus*、*M.sowerbyi*);钻螺属(*Opeas*);瓶螺属(*Pomacea*) (*P.canaticulata*);瓦娄蜗牛属(*Vallonia*)和*Zanitoides*。

[0593] 根据本发明的组合物可以用于其中的有用植物作物包括多年生和一年生作物,例如浆果植物,例如黑莓、蓝莓、蔓越莓、树莓以及草莓;谷类,例如大麦、玉米(maize或corn)、小米、燕麦、水稻、黑麦、高粱、黑小麦以及小麦;纤维植物,例如棉花、亚麻、大麻、黄麻和剑麻;大田作物,例如糖甜菜和饲料甜菜、咖啡、啤酒花、芥菜、油菜(卡诺拉)、罂粟、甘蔗、向日葵、茶以及烟草;果树,例如苹果、杏、鳄梨、香蕉、樱桃、柑橘、油桃、桃、梨以及李子;草,例如百慕达草、蓝草、本特草、蜈蚣草、牛毛草、黑麦草、圣奥古斯丁草以及结缕草;药草,例如罗勒、琉璃苣、细香葱、胡荽、薰衣草、独活草、薄荷、牛至、荷兰芹、迷迭香、鼠尾草以及百里香;豆类,例如菜豆、小扁豆、豌豆和大豆;坚果,例如杏仁、腰果、落花生、榛子、花生、山核桃、开心果和核桃;棕榈植物,例如油棕榈;观赏植物,例如花、灌木和树;其他树木,例如可可、椰子、橄榄和橡胶;蔬菜,例如芦笋、茄子、西兰花、卷心菜、胡萝卜、黄瓜、大蒜、莴苣、西葫芦、甜瓜、秋葵、洋葱、胡椒、马铃薯、南瓜、大黄、菠菜和番茄;和葡萄藤,例如葡萄。

[0594] 作物应当被理解为是天然存在的、通过常规的育种方法获得或通过基因工程获得的那些作物。它们包括包含所谓的输出型(output)性状(例如改进的储存稳定性、更高的营养价值以及改进的风味)的作物。

[0595] 作物应被理解为还包括已经被赋予对除草剂(像溴草腈)或多种类别的除草剂(例如ALS-、EPSPS-、GS-、HPPD-和PPO-抑制剂)的耐受性的那些作物。通过常规的育种方法已经赋予其对咪唑啉酮类(例如,甲氧咪草烟)的耐受性的作物的一个实例是**Clearfield®**夏季卡诺拉。通过遗传工程方法而被赋予了对除草剂的耐受性的作物的实例包括例如草甘膦和草丁膦抗性玉米品种,这些玉米品种在**RoundupReady®**、**HerculexI®**和**LibertyLink®**商标名下是可商购的。

[0596] 作物还应被理解为天然地是或已经赋予对有害昆虫的抗性的那些作物。这包括通过使用重组DNA技术转化从而例如能够合成一种或多种选择性作用毒素的植物,这些毒素例如是从如产毒素的细菌已知的。可以被表达的毒素的实例包括 $\delta$ -内毒素,营养期杀昆虫蛋白(Vip),细菌定殖线虫的杀昆虫蛋白,以及由蝎子、蛛形纲动物、黄蜂和真菌产生的毒素。

[0597] 已经被修饰为表达苏云金芽孢杆菌毒素的作物的实例是Bt maize**KnockOut®**(先正达种子(Syngenta Seeds))。包括编码杀昆虫抗性并且由此表达多于一种毒素的多于一种基因的作物的实例是**VipCot®**(先正达种子)。作物或其种子材料还可以是对多种类型的有害生物具有抗性(当通过遗传修饰产生时的所谓的叠加转基因事件)。例如,植物可以具有表达杀昆虫蛋白同时耐受除草剂的能力,例如**HerculexI®**(陶氏益农公司(Dow AgroSciences),先锋良种国际公司(Pioneer Hi-Bred International))。

[0598] 根据本发明的组合物的其他使用范围是保护所储存的货物和储藏室以及保护原

材料,如木材、纺织品、地板或建筑物,以及在卫生领域中,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。

[0599] 本发明还提供了用于控制害虫(如蚊科和其他的疾病媒介物)的方法;也可参见 [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质施用本发明的组合物。通过举例,通过本发明的方法预期了表面(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(或可以用于在这些物品的制造中使用)。本发明的另外的目的因此是选自包含含有具有式(I)的化合物的组合物的无纺和织物材料的基质。

[0600] 在一个实施例中,用于控制这样的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质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质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,通过本发明的方法预期了表面(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,考虑了施用这样的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(或可以用于在这些物品的制造中)的织物材料。

[0601] 待处理的基质(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。

[0602] 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。

[0603] 在树木注射/树干处理领域中,根据本发明的这些化合物特别适合于对抗来自上述的鳞翅目和来自鞘翅目的钻木昆虫,尤其是对抗下表A和B中列出的钻木虫:

[0604] 表A.具有经济重要性的外来钻木虫的实例。

	科	种	受侵染的宿主或作物
	吉丁虫科	白蜡窄吉丁	白蜡木 (Ash)
[0605]	天牛科	光肩天牛	硬木
	小蠹科	<i>Xylosandrus crassiusculus</i>	硬木
		削尾材小蠹	硬木

[0606]		纵坑切梢小蠹	松柏类植物
--------	--	--------	-------

[0607] 表B.具有经济重要性的本地钻木虫的实例。

[0608]

科	种	受侵染的宿主或作物
吉丁虫科	桦铜窄吉丁 ( <i>Agrilus anxius</i> )	桦树
	磨光窄吉丁 ( <i>Agrilus politus</i> )	柳树、枫树
	<i>Agrilus sayi</i>	杨梅、香蕨木
	<i>Agrilus vittaticollis</i>	苹果树、梨树、蔓越橘、唐棣、山楂树
	革扁头吉丁 ( <i>Chrysobothris femorata</i> )	苹果、杏、山毛榉、白蜡槭、樱桃树、栗树、红醋栗树、榆树、山楂树、朴树、山核桃、欧洲七叶树、菩提树、枫树、欧洲花楸树、橡树、美洲山核桃树、梨树、桃树、柿子树、李子树、杨树、温柏、美国紫荆、唐棣、美国梧桐、核桃树、柳树
	<i>Texania campestris</i>	椴木、山毛榉、枫树、橡树、美国梧桐、柳树、黄杨
天牛科	对山毛榉天牛 ( <i>Goes pulverulentus</i> )	山毛榉、榆树、纳托尔 (Nuttall)、柳树、黑橡树、樱皮镰状栎、黑栎、美国梧桐
	虎橡天牛 ( <i>Goes tigrinus</i> )	橡树
	黑腹尼虎天牛 ( <i>Neoclytus acuminatus</i> )	白蜡木、山核桃树、橡树、核桃树、桦树、山毛榉、枫树、美洲铁木 (Eastern hophornbeam)、山茱萸、柿子树、美国紫荆、冬青、朴树、洋槐、美国皂荚木 (Honeylocust)、黄杨、栗树、奥塞奇橙木 (Osage-orange)、黄樟、紫丁香、短叶紫杉 (Mountain-mahogany)、梨树、樱桃树、李子树、桃树、苹果树、榆树、菩提树、枫香
	三线无花果天牛 ( <i>Neoptychodes trilineatus</i> )	无花果树、赤杨木、桑树、柳树、网叶朴树 (Netleaf hackberry)
	灰翅筒天牛 ( <i>Oberea ocellata</i> )	漆树、苹果树、桃树、李子树、梨树、红醋栗树、黑莓
	<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 ( <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、桤树、橡树、朴树、枫树、果树
	对杨黄斑楔天牛 ( <i>Saperda calcarata</i> )	杨树
	<i>Strophiona nitens</i>	栗树、橡树、山核桃树、核桃树、山毛

[0609]

科	种	受侵染的宿主或作物
		桦、枫树
小蠹科	<i>Corthylus columbianus</i>	枫树、橡树、黄杨、山毛榉、白蜡槭、美国梧桐、桦树、菩提树、栗树、榆树
	南方松大小蠹 ( <i>Dendroctonus frontalis</i> )	松树
	美桦毛小蠹 ( <i>Dryocoetes betulae</i> )	桦树、枫香、野樱桃树、山毛榉、梨树
	黄带芳小蠹 ( <i>Monarthrum fasciatum</i> )	橡树、枫树、桦树、栗树、枫香、蓝果木、杨树、山核桃树、含羞草、苹果树、桃树、松树
	桃腮角小蠹 ( <i>Phloeotribus liminaris</i> )	桃树、樱桃树、李子树、黑樱桃树、榆树、桑树、欧洲花楸树
	<i>Pseudopityophthorus pruinus</i>	橡树、美国山毛榉木、黑樱桃树、契卡索李子树 (Chickasaw plum)、栗树、枫树、山核桃树、角树、铁木
透翅蛾科	栋透翅蛾 ( <i>Paranthrene simulans</i> )	橡树、美洲栗树
	<i>Sannina uroceriformis</i>	柿子树
	小桃翅蛾	桃树、李子树、油桃树、樱桃树、杏树、扁桃树、黑樱桃树
	李桃翅蛾 ( <i>Synanthedon pictipes</i> )	桃树、李子树、樱桃树、山毛榉、黑樱桃树
	<i>Synanthedon rubrofascia</i>	蓝果树
	<i>Synanthedon scitula</i>	山茱萸、美洲山核桃、山核桃树、橡树、栗树、山毛榉、桦树、黑樱桃树、榆树、欧洲花楸树、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

[0610] 本发明也可以用于控制任何可以存在于草坪草中的昆虫有害生物,包括例如甲虫、毛虫、火蚁、地面珍珠 (ground pearl)、千足虫、潮虫、螨虫、蜈蚣、介壳虫、粉蚧、沫蝉、南方麦小蜂以及蛴螬。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。

[0611] 具体而言,本发明可以用于控制取食草坪草的根部的昆虫有害生物,这些昆虫有害生物包括蛴螬 (如圆头犀金龟属 (*Cyclocephala* spp.) (例如蒙面金龟子, *C. lurida*)、*Rhizotrogus* 属 (例如欧洲金龟子, 欧洲切根鳃金龟 (*R. majalis*))、黄榆属 (*Cotinus* spp.) (例如绿六月甲虫 (Green June beetle), *C. nitida*)、弧丽金龟属 (*Popillia* spp.) (例如日本甲虫, 龟纹瓢虫 (*P. japonica*))、鳃角金龟属 (*Phyllophaga* spp.) (例如五月/六月甲虫)、*Ataenius* 属 (例如草坪草黑金龟 (Black turfgrass ataenius), *A. spretulus*)、绒毛金龟属 (*Maladera* spp.) (例如亚洲花园甲虫 (Asiatic garden beetle), *M. castanea*) 以及 *Tomarus* 属), 地面珍珠 (硕蛴属 (*Margarodes* spp.)), 蜈蚣 (褐黄色的、南方的、以及短翅的; 痣蟋蟀属 (*Scapteriscus* spp.)), 非洲蜈蚣 (*Gryllotalpa africana*)) 以及大蚊幼虫 (leatherjackets) (欧洲大蚊 (European crane fly), 大蚊属 (*Tipula* spp.))。

[0612] 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*),和常见夜蛾一星黏虫(*Pseudaletia unipuncta*))、切根虫,象鼻虫(尖隐喙象属(*Sphenophorus* spp.),如*S. venatus verstitus*和牧草长喙象(*S. parvulus*))以及草地螟(如草螟属(*Crambus* spp.)和热带草地螟,*Herpetogramma phaeopteralis*)。

[0613] 本发明还可以用于控制在地上生活并取食草坪草叶子的草坪草中的昆虫有害生物,这些昆虫有害生物包括麦小蝽(如南方麦小蝽,南方杆长蝽(*Blissus insularis*))、狗牙根螨(*Bermudagrass mite*) (*Eriophyes cynodoniensis*)、盖氏虎尾草粉蚧(草竹粉蚧(*Antonina graminis*))、两线沫蝉(*Prospapia bicincta*)、叶蝉、切根虫(夜蛾科)、以及麦二叉蚜。

[0614] 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*))。

[0615] 在卫生领域中,根据本发明的组合物是有效地对抗外寄生虫如硬蜱、软蜱、疥螨、秋螨、蝇(叮咬和舔舐)、寄生性蝇幼虫,虱、发虱、鸟虱和跳蚤。

[0616] 这样的寄生虫的实例是:

[0617] 虱目:血虱属、长颚虱属、人虱属和阴虱属、盲虱属。

[0618] 食毛目:毛羽虱属、短角鸟虱属、鸭虱属、牛羽虱属、*Werneckiella*属、*Lepikentron*属、畜虱属、啮毛虱属以及猫羽虱属。

[0619] 双翅目及长角亚目和短角亚目,例如伊蚊属、按蚊属、库蚊属、蚋属、真蚋属、白蛉属、罗蛉属、库蠓属、斑虻属、驼背虻属、黄虻属、虻属、麻虻属、*Philipomyia*属、蜂虱蝇属、家蝇属、齿股蝇属、螫蝇属、黑角蝇属、莫蝇属、厕蝇属、舌蝇属、丽蝇属、绿蝇属、金蝇属、污蝇属、麻蝇属、狂蝇属、皮蝇属、胃蝇属、虱蝇属、羊虱蝇属和蜉蝣属。

[0620] 蚤目,例如蚤属、栉头蚤属、客蚤属、角叶蚤属。

[0621] 异翅目,例如臭虫属、锥鼻虫属、红猎蝽属、锥蝽属。

[0622] 蜚蠊目,例如东方蜚蠊、美洲大蠊、德国小蠊以及夏柏拉蟑螂属。

[0623] 蜱螨亚纲(螨科)和后气门目和中气门目,例如锐缘蜱属、钝缘蜱属、耳蜱属、硬蜱属、钝眼蜱属、牛蜱属、革蜱属、血蜱属、璃眼蜱属、扇头蜱属、皮刺螨属、刺利螨属、肺刺螨属、胸刺螨属和瓦螨属。

[0624] 轴螨目(前气门亚目)和粉螨目(无气门亚目),例如蜂盾螨属、姬螯属、禽螯螨属、肉螨属、疮螨属、蠕形螨属、恙螨属、牦螨属、粉螨属、食酪螨属、嗜木螨属、颈下螨属、翅螨属、痒螨属、皮螨属、耳疥螨属、疥螨属、耳螨属、鸟疥螨属、胞螨属以及鸡雏螨属。

[0625] 根据本发明的组合物还适用于保护材料如木材、纺织品、塑料、粘合剂、胶、漆料、纸张和卡片、皮革、地板和建筑等免受昆虫侵染。

[0626] 根据本发明的组合物可以用于例如对抗以下有害生物:甲虫,如北美家天牛、长毛天牛、家具窃蠹、红毛窃蠹、梳角细脉窃蠹、石斛、松芽枝窃蠹、松产品窃蠹、褐粉蠹、非洲粉蠹、南方粉蠹、栎粉蠹、柔毛粉蠹、胸粉蠹、鳞毛粉蠹、材小蠹属、条木小蠹属、咖啡黑长蠹、树长蠹、棕异翅长蠹、双棘长蠹属与竹长蠹;以及膜翅类昆虫,如蓝黑树蜂、云杉大树蜂、泰加大树蜂与大树蜂;以及白蚁,如欧洲木白蚁、麻头堆砂白蚁、印巴结构木异白蚁、黄胸散白蚁、桑特散白蚁、散白蚁、达尔文澳白蚁、内华达古白蚁与家白蚁;以及蛀虫,如衣鱼。

[0627] 通过添加其他有杀昆虫、杀螨和/或杀真菌活性的成分,根据本发明的组合物的活



性可以显著地加宽,并且适合于当时的环境。具有式(I)的化合物与其他具有杀昆虫、杀螨和/或杀真菌活性的成分的混合物还可以具有进一步地、令人惊讶的优点,这些优点还可以在更宽的含义上描述为协同活性。例如,植物对其更好的耐受性、降低的植物毒性,昆虫可以在它们的不同发育阶段得到控制或者在它们的生产期间(例如,在研磨或者混合过程中,在它们的储藏或它们的使用过程中)更好的行为。

[0628] 在这里,合适的活性成分的添加物是例如下面类别的活性成分的代表物:有机磷化合物、硝基苯酚衍生物、硫脲、保幼激素、甲脒、二苯甲酮衍生物、脲类、吡咯衍生物、氨基甲酸酯、拟除虫菊酯、氯化烃、酰基脲、吡啶基亚甲基氨基衍生物、大环内酯类、新烟碱以及苏云金杆菌制剂。

[0629] 以下具有式(I)的化合物与活性成分的混合物是优选的(缩写“TX”意为“选自下组的一种化合物,该组由描述于本发明的表1至162、B-1至B-270、C-1至C-270、A、B以及F中的化合物组成”):

[0630] 佐剂,该佐剂选自由以下物质组成的组:石油(别名)(628)+TX,

[0631] 杀螨剂,该杀螨剂选自由以下项组成的物质组:1,1-双(4-氯苯基)-2-乙氧基乙醇(IUPAC名称)(910)+TX、2,4-二氯苯基苯磺酸酯(IUPAC/化学文摘名)(1059)+TX、2-氟-N-甲基-N-1-萘乙酰胺(IUPAC名称)(1295)+TX、4-氯苯基苯基砒(IUPAC名称)(981)+TX、阿维菌素(1)+TX、灭螨醌(3)+TX、乙酰虫腈[CCN]+TX、氟丙菊酯(9)+TX、涕灭威(16)+TX、涕灭砒威(863)+TX、 $\alpha$ -氯氰菊酯(202)+TX、赛硫磷(870)+TX、磺胺螨酯[CCN]+TX、果满磷(amidothioate)(872)+TX、胺吸磷(875)+TX、胺吸磷草酸氢盐(875)+TX、双甲脒(24)+TX、杀螨特(881)+TX、三氧化二砷(882)+TX、AVI 382(化合物代码)+TX、AZ 60541(化合物代码)+TX、益棉磷(44)+TX、保棉磷(azinphos-methyl)(45)+TX、偶氮苯(IUPAC名称)(888)+TX、三唑锡(azacyclotin)(46)+TX、偶氮磷(azothoate)(889)+TX、苯菌灵(62)+TX、苯诺沙磷(benoxafos)(别名)[CCN]+TX、苯螨特(benzoximate)(71)+TX、苯甲酸苄酯(IUPAC名称)[CCN]+TX、联苯胂酯(74)+TX、联苯菊酯(76)+TX、乐杀螨(907)+TX、溴灭菊酯(brofenvaterate)(别名)+TX、溴烯杀(bromocyclen)(918)+TX、溴硫磷(920)+TX、乙基溴硫磷(921)+TX、溴螨酯(bromopropylate)(94)+TX、噻嗪酮(99)+TX、丁酮威(103)+TX、丁酮砒威(104)+TX、丁基哒螨灵(别名)+TX、多硫化钙(IUPAC名称)(111)+TX、毒杀芬(camphenchlor)(941)+TX、氯灭杀威(carbanolate)(943)+TX、甲萘威(115)+TX、克百威(carbofuran)(118)+TX、卡波硫磷(947)+TX、CGA 50' 439(开发代码)(125)+TX、灭螨猛(chinomethionat)(126)+TX、杀螨醚(chlorbenside)(959)+TX、杀虫脒(964)+TX、杀虫脒盐酸盐(964)+TX、溴虫腈(130)+TX、敌螨(968)+TX、杀螨酯(chlorfenson)(970)+TX、敌螨特(chlorfensulfide)(971)+TX、氯芬磷(131)+TX、乙酯杀螨醇(chlorobenzilate)(975)+TX、伊托明(chloromebuform)(977)+TX、灭虫脒(chloromethiuron)(978)+TX、丙酯杀螨醇(chloropropylate)(983)+TX、毒死蜱(145)+TX、甲基毒死蜱(146)+TX、虫螨磷(chlorthiophos)(994)+TX、瓜菊酯(cinerin) I (696)+TX、瓜菊酯II (696)+TX、瓜叶除虫菊酯(cinerins)(696)+TX、四螨嗪(158)+TX、氯氰碘柳胺(别名)[CCN]+TX、库马磷(174)+TX、克罗米通(别名)[CCN]+TX、巴毒磷(crotoxyphos)(1010)+TX、硫杂灵(1013)+TX、果虫磷(cyanthoate)(1020)+TX、丁氟螨酯(CAS登记号:400882-07-7)+TX、三氯氟氰菊酯(196)+TX、三环锡(199)+TX、氯氰菊酯(201)+TX、DCPM(1032)+TX、DDT(219)+TX、田乐磷

(demephion) (1037) +TX、田乐磷-O (1037) +TX、田乐磷-S (1037) +TX、内吸磷 (demeton) (1038) +TX、甲基内吸磷 (224) +TX、内吸磷-O (1038) +TX、甲基内吸磷-O (demeton-O-methyl) (224) +TX、内吸磷-S (1038) +TX、甲基内吸磷-S (224) +TX、内吸磷-S-甲基磺隆 (demeton-S-methylsulfon) (1039) +TX、杀螨隆 (226) +TX、氯亚胺硫磷 (dialifos) (1042) +TX、二嗪磷 (227) +TX、苯氟磺胺 (230) +TX、敌敌畏 (236) +TX、甲氟磷 (dicliphos) (别名) +TX、开乐散 (242) +TX、百治磷 (243) +TX、遍地克 (1071) +TX、甲氟磷 (dimefox) (1081) +TX、乐果 (262) +TX、二甲杀螨霉素 (dinactin) (别名) (653) +TX、消螨酚 (dinex) (1089) +TX、消螨酚 (dinex-diclexine) (1089) +TX、消螨通 (dinobuton) (269) +TX、敌螨普 (dinocap) (270) +TX、敌螨普-4[CCN] +TX、敌螨普-6[CCN] +TX、敌螨消 (dinocton) (1090) +TX、硝戊酯 (dinopenton) (1092) +TX、硝辛酯 (dinosulfon) (1097) +TX、硝丁酯 (dinoterbon) (1098) +TX、敌恶磷 (1102) +TX、二苯砷 (IUPAC名称) (1103) +TX、双硫仑 (别名) [CCN] +TX、乙拌磷 (278) +TX、DNOC (282) +TX、苯氧炔螨 (dofenapyn) (1113) +TX、多拉菌素 (别名) [CCN] +TX、硫丹 (294) +TX、因毒磷 (endothion) (1121) +TX、EPN (297) +TX、依立诺克丁 (别名) [CCN] +TX、乙硫磷 (309) +TX、益硫磷 (ethoate-methyl) (1134) +TX、乙螨唑 (etoxazole) (320) +TX、乙嘧硫磷 (etrimfos) (1142) +TX、抗螨唑 (fenazaflor) (1147) +TX、啞螨醚 (328) +TX、苯丁锡 (fenbutatin oxide) (330) +TX、苯硫威 (fenothiocarb) (337) +TX、甲氰菊酯 (342) +TX、吡螨胺 (fenpyrad) (别名) +TX、啞螨酯 (fenpyroximate) (345) +TX、芬螨酯 (fenson) (1157) +TX、氟硝二苯胺 (fentrifanil) (1161) +TX、氰戊菊酯 (349) +TX、氟虫腈 (354) +TX、啞螨酯 (fluacrypyrim) (360) +TX、氟佐隆 (1166) +TX、氟螨啉 (flubenzimine) (1167) +TX、氟螨脲 (366) +TX、氟氰戊菊酯 (flucythrinate) (367) +TX、联氟螨 (fluenetil) (1169) +TX、氟虫脲 (370) +TX、氟氯苯菊酯 (flumethrin) (372) +TX、氟杀螨 (fluorbenside) (1174) +TX、氟胺氰菊酯 (fluvalinate) (1184) +TX、FMC 1137 (开发代码) (1185) +TX、抗螨脲 (405) +TX、抗螨脲盐酸盐 (405) +TX、安硫磷 (formothion) (1192) +TX、胺甲威 (formparanate) (1193) +TX、 $\gamma$ -HCH (430) +TX、果绿啉 (glyodin) (1205) +TX、苜螨醚 (halfenprox) (424) +TX、庚烯磷 (heptenophos) (432) +TX、十六碳烷基环丙烷羧酸酯 (IUPAC/化学文摘名) (1216) +TX、噻螨酮 (441) +TX、碘甲烷 (IUPAC名称) (542) +TX、水胺硫磷 (isocarbophos) (别名) (473) +TX、异丙基O-(甲氧基氨基硫代磷酰基) 水杨酸酯 (IUPAC名称) (473) +TX、伊维菌素 (别名) [CCN] +TX、茉莉菊酯 (jasmolin) I (696) +TX、茉莉菊酯II (696) +TX、碘硫磷 (jodfenphos) (1248) +TX、林丹 (430) +TX、虱螨脲 (490) +TX、马拉硫磷 (492) +TX、丙螨氰 (malonoben) (1254) +TX、灭蚜磷 (mecarbam) (502) +TX、地胺磷 (mephosfolan) (1261) +TX、甲硫芬 (别名) [CCN] +TX、虫螨畏 (methacrifos) (1266) +TX、甲胺磷 (527) +TX、杀扑磷 (529) +TX、灭虫威 (530) +TX、灭多虫 (531) +TX、溴甲烷 (537) +TX、速灭威 (metolcarb) (550) +TX、速灭磷 (556) +TX、自克威 (mexacarbate) (1290) +TX、弥拜菌素 (milbemectin) (557) +TX、杀螨菌素肟 (milbemycin oxime) (别名) [CCN] +TX、丙胺氟磷 (mipafos) (1293) +TX、久效磷 (561) +TX、茂硫磷 (morphothion) (1300) +TX、莫昔克丁 (别名) [CCN] +TX、二溴磷 (naled) (567) +TX、NC-184 (化合物代码) +TX、NC-512 (化合物代码) +TX、氟蚊灵 (nifluridide) (1309) +TX、尼柯霉素 (别名) [CCN] +TX、戊氰威 (nitrilacarb) (1313) +TX、戊氰威 (nitrilacarb) 1:1氯化锌络合物 (1313) +TX、NNI-0101 (化合物代码) +TX、NNI-0250 (化合物代码) +TX、氧乐果 (594) +TX、杀线威 (602) +TX、亚异砷磷 (oxydeprofos) (1324) +TX、砷拌磷 (oxydisulfoton) (1325) +TX、pp'-

DDT (219) +TX、对硫磷 (615) +TX、氯菊酯 (626) +TX、石油 (别名) (628) +TX、芬硫磷 (1330) +TX、稻丰散 (631) +TX、甲拌磷 (636) +TX、伏杀硫磷 (637) +TX、硫环磷 (phosfolan) (1338) +TX、亚胺硫磷 (638) +TX、磷胺 (639) +TX、辛硫磷 (642) +TX、甲基嘧啶磷 (652) +TX、氯化松节油 (polychloroterpenes) (传统名称) (1347) +TX、杀螨霉素 (polynactins) (别名) (653) +TX、丙氯诺 (1350) +TX、丙溴磷 (662) +TX、蜚虱威 (promacyl) (1354) +TX、克螨特 (671) +TX、胺丙畏 (propetamphos) (673) +TX、残杀威 (678) +TX、乙噻唑磷 (prothidathion) (1360) +TX、发硫磷 (prothoate) (1362) +TX、除虫菊酯 I (696) +TX、除虫菊酯 II (696) +TX、除虫菊素 (pyrethrins) (696) +TX、哒螨灵 (699) +TX、哒嗪硫磷 (pyridaphenthion) (701) +TX、嘧啶醚 (pyrimidifen) (706) +TX、嘧硫磷 (1370) +TX、喹硫磷 (quinalphos) (711) +TX、喹硫磷 (quintiofos) (1381) +TX、R-1492 (开发代码) (1382) +TX、RA-17 (开发代码) (1383) +TX、鱼藤酮 (722) +TX、八甲磷 (schradan) (1389) +TX、克线丹 (sebufos) (别名) +TX、塞拉菌素 (selamectin) (别名) [CCN] +TX、SI-0009 (化合物代码) +TX、苏硫磷 (sophamide) (1402) +TX、季酮螨酯 (738) +TX、螺甲螨酯 (739) +TX、SSI-121 (开发代码) (1404) +TX、舒非仑 (别名) [CCN] +TX、氟虫胺 (sulfluramid) (750) +TX、治螟磷 (sulfotep) (753) +TX、硫磺 (754) +TX、SZI-121 (开发代码) (757) +TX、氟胺氰菊酯 (tau-fluvalinate) (398) +TX、吡螨胺 (763) +TX、TEPP (1417) +TX、叔丁威 (terbam) (别名) +TX、司替罗磷 (777) +TX、三氯杀螨砒 (tetradifon) (786) +TX、杀螨霉素 (tetranactin) (别名) (653) +TX、杀螨硫醚 (tetrasul) (1425) +TX、thiafenox (别名) +TX、抗虫威 (thiocarboxime) (1431) +TX、久效威 (thiofanox) (800) +TX、甲基乙拌磷 (thiometon) (801) +TX、克杀螨 (1436) +TX、苏云金素 (thuringiensin) (别名) [CCN] +TX、威菌磷 (triamiphos) (1441) +TX、苯螨噻 (triarathene) (1443) +TX、三唑磷 (820) (别名) +TX、啞呀威 (triazuron) +TX、敌百虫 (824) +TX、三氯丙氧磷 (trifenofos) (1455) +TX、三活菌素 (trinactin) (别名) (653) +TX、蚜灭多 (847) +TX、氟吡唑虫 (vaniliprole) [CCN] 和 YI-5302 (化合物代码) +TX,

[0632] 杀藻剂, 该杀藻剂选自由以下物质组成的组: 3-苯并[b]噻吩-2-基-5,6-二氢-1,4,2-噁噻嗪-4-氧化物 [CCN] +TX、二辛酸铜 (IUPAC 名称) (170) +TX、硫酸铜 (172) +TX、cybutryne [CCN] +TX、二氢茶醌 (dichlone) (1052) +TX、双氯酚 (232) +TX、菌多酸 (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、三苯锡乙酸盐 (IUPAC 名称) (347) 和氢氧化三苯锡 (IUPAC 名称) (347) +TX,

[0633] 驱蠕虫剂, 该驱蠕虫剂选自由以下物质组成的组: 阿巴美丁 (1) +TX、克芦磷酯 (1011) +TX、多拉克汀 (别名) [CCN] +TX、依马克丁 (291) +TX、依马克丁苯甲酸酯 (291) +TX、依立诺克丁 (别名) [CCN] +TX、伊维菌素 (别名) [CCN] +TX、米尔倍霉素 (别名) [CCN] +TX、莫昔克丁 (别名) [CCN] +TX、哌嗪 [CCN] +TX、塞拉菌素 (selamectin) (别名) [CCN] +TX、多杀菌素 (737) 和硫菌灵 (thiophanate) (1435) +TX,

[0634] 杀鸟剂, 该杀鸟剂选自由以下物质组成的组: 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,

[0635] 杀细菌剂, 该杀细菌剂选自由以下物质组成的组: 1-羟基-1H-吡啶-2-硫酮 (IUPAC 名称) (1222) +TX、4-(喹啉啉-2-基氨基) 苯磺酰胺 (IUPAC 名称) (748) +TX、8-羟基喹啉硫酸盐 (446) +TX、溴硝醇 (97) +TX、二辛酸铜 (IUPAC 名称) (170) +TX、氢氧化铜 (IUPAC 名称) (169)

+TX、甲酚[CCN]+TX、双氯酚(232)+TX、双吡硫翁(1105)+TX、多地辛(1112)+TX、敌磺钠(fenaminosulf)(1144)+TX、甲醛(404)+TX、汞加芬(别名)[CCN]+TX、春雷霉素(483)+TX、春雷霉素盐酸盐水合物(483)+TX、二(二甲基二硫代氨基甲酸盐)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、烯丙苯噻唑(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,

[0636] 生物试剂,该生物试剂选自由以下物质构成的组:棉褐带卷蛾颗粒体病毒(Adoxophyes orana GV)(别名)(12)+TX、放射形土壤杆菌(别名)(13)+TX、捕食螨(别名)(19)+TX、芹菜夜蛾核多角体病毒(Anagrapha falcifera NPV)(别名)(28)+TX、Anagrus atomus(别名)(29)+TX、蚜虫寄生蜂(别名)(33)+TX、棉蚜寄生蜂(别名)(34)+TX、食蚜瘿蚊(别名)(35)+TX、苜蓿银纹夜蛾核多角体病毒(Autographa californica NPV)(别名)(38)+TX、坚强芽孢杆菌(别名)(48)+TX、球形芽孢杆菌(学名)(49)+TX、苏云金杆菌(Bacillus thuringiensis Berliner)(学名)(51)+TX、苏云金杆菌鮎泽亚种(Bacillus thuringiensis subsp.aizawai)(学名)(51)+TX、苏云金杆菌以色列亚种(Bacillus thuringiensis subsp.israelensis)(学名)(51)+TX、苏云金杆菌日本亚种(Bacillus thuringiensis subsp.japonensis)(学名)(51)+TX、苏云金杆菌k.(Bacillus thuringiensis subsp.kurstaki)(学名)(51)+TX、苏云金杆菌t.(Bacillus thuringiensis subsp.tenebrionis)(学名)(51)+TX、球孢白僵菌(别名)(53)+TX、布氏白僵菌(别名)(54)+TX、草蜻蛉(别名)(151)+TX、孟氏隐唇瓢虫(别名)(178)+TX、苹果蠹蛾颗粒体病毒(Cydia pomonella GV)(别名)(191)+TX、西伯利亚离颚茧蜂(别名)(212)+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂(别名)(254)+TX、丽蚜小蜂(学名)(293)+TX、桠角蚜小蜂(别名)(300)+TX、玉米穗夜蛾核多角体病毒(Helicoverpa zea NPV)(别名)(431)+TX、嗜菌异小杆线虫和H.megidis(别名)(433)+TX、会聚长足瓢虫(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、甘蓝夜蛾核多角体病毒(Mamestra brassicae NPV)(别名)(494)+TX、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、松黄叶蜂(Neodiprion sertifer)核多角体病毒和红头松树叶蜂(N.lecontei)核多角体病毒(别名)(575)+TX、小花蝽(别名)(596)+TX、玫烟色拟青霉(别名)(613)+TX、智利捕植螨(别名)(644)+TX、甜菜夜蛾(Spodoptera exigua multicapsid)多核衣壳核多角体病毒(学名)(741)+TX、毛蚊线虫(别名)(742)+TX、小卷蛾斯氏线虫(别名)(742)+TX、夜蛾斯氏线虫(别名)(742)+TX、Steinernema glaseri(别名)(742)+TX、Steinernema riobrave(别名)(742)+TX、Steinernema riobravo(别名)(742)+TX、Steinernema scapterisci(别名)(742)+TX、斯氏线虫属(别名)(742)+TX、赤眼蜂属(别名)(826)+TX、西方盲走螨(别名)(844)和蜡蚧轮枝菌(别名)(848)+TX,

[0637] 土壤消毒剂,该土壤消毒剂选自由以下物质组成的组:碘甲烷(IUPAC名称)(542)和甲基溴(537)+TX,

[0638] 化学不育剂,该化学不育剂选自由以下物质组成的组:唑磷嗪(apholate)[CCN]+TX、双(氮丙啶)甲氨基膦硫化物(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、不育特(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,

[0639] 昆虫信息素,该昆虫信息素选自由以下物质组成的组:(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-甲基十八-1-烯(IUPAC名称)(545)+TX、4-甲基壬醛-5-醇与4-甲基壬醛-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(brevicomine)(别名)[CCN]+TX、十二碳二烯醇(codlure)(别名)[CCN]+TX、十二碳二烯醇(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、多米尼加(dominicalure)(别名)[CCN]+TX、4-甲基辛酸乙酯(IUPAC名称)(317)+TX、丁香酚(别名)[CCN]+TX、南部松小蠹集合信息素(frontalin)(别名)[CCN]+TX、诱虫十六酯(gossypure)(别名)(420)+TX、诱杀烯混剂(grandlure)(421)+TX、诱杀烯混剂I(别名)(421)+TX、诱杀烯混剂II(别名)(421)+TX、诱杀烯混剂III(别名)(421)+TX、诱杀烯混剂IV(别名)(421)+TX、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、里尼汀(lineatin)(别名)[CCN]+TX、利特乐(litlure)(别名)[CCN]+TX、粉纹夜蛾性诱剂(looplure)(别名)[CCN]+TX、诱杀酯(medlure)[CCN]+TX、蒙托么克酸(megatomoic acid)(别名)[CCN]+TX、诱虫醚(methyl eugenol)(别名)(540)+TX、诱虫烯(muscalure)(563)+TX、十八-2,13-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(588)+TX、十八-3,13-二烯-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、索地丁(sordidin)(别名)(736)+TX、食菌甲诱醇(sulcatol)(别名)[CCN]+TX、十四-11-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)和创科尔(trunc-call)(别名)[CCN]+TX,

[0640] 昆虫驱避剂,该昆虫驱避剂选自由以下物质组成的组: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、驱蚊酯(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、氨羰基甲酸酯(oxamate)[CCN]和羟哌酯[CCN]+TX,

[0641] 一种杀昆虫剂,该杀昆虫剂选自由以下物质组成的组:1-二氯-1-硝基乙烷(IUPAC/化学文摘名称)(1058)+TX、1,1-二氯-2,2-二(4-乙基苯基)乙烷(IUPAC名称)(1056)+TX、1,2-二氯丙烷(IUPAC/化学文摘名称)(1062)+TX、带有1,3-二氯丙烯的1,2-二氯丙烷(IUPAC名称)(1063)+TX、1-溴-2-氯乙烷(IUPAC/化学文摘名称)(916)+TX、乙酸2,2,2-三氯-1-(3,4-二氯苯基)乙基酯(IUPAC名称)(1451)+TX、2,2-二氯乙烯基2-乙基亚磺酰基乙基甲基磷酸酯(IUPAC名称)(1066)+TX、二甲基氨基甲酸2-(1,3-二硫杂环戊烷-2-基)苯基酯(IUPAC/化学文摘名称)(1109)+TX、硫氰酸2-(2-丁氧基乙氧基)乙基酯(IUPAC/化学文摘名称)(935)+TX、甲基氨基甲酸2-(4,5-二甲基-1,3-二氧环戊烷-2-基)苯基酯(IUPAC/化学文摘名称)(1084)+TX、2-(4-氯-3,5-二甲苯基氧基)乙醇(IUPAC名称)(986)+TX、2-氯乙烯基二乙基磷酸酯(IUPAC名称)(984)+TX、2-咪唑啉酮(IUPAC名称)(1225)+TX、2-异戊酰基茚满-1,3-二酮(IUPAC名称)(1246)+TX、甲基氨基甲酸2-甲基(丙-2-炔基)氨基苯基酯(IUPAC名称)(1284)+TX、月桂酸2-硫氰基乙基酯(IUPAC名称)(1433)+TX、3-溴-1-氯丙-1-烯(IUPAC名称)(917)+TX、二甲基氨基甲酸3-甲基-1-苯基吡唑-5-基酯(IUPAC名称)(1283)+TX、甲基氨基甲酸4-甲基(丙-2-炔基)氨基-3,5-二甲苯基酯(IUPAC名称)(1285)+TX、二甲基氨基甲酸5,5-二甲基-3-氧代环己-1-烯基酯(IUPAC名称)(1085)+TX、阿维菌素(1)+TX、乙酰甲胺磷(2)+TX、啉虫脒(4)+TX、家蝇磷(别名)[CCN]+TX、乙酰虫腈[CCN]+TX、氟丙菊酯(9)+TX、丙烯腈(IUPAC名称)(861)+TX、棉铃威(15)+TX、涕灭威(16)+TX、涕灭砒威(863)+TX、氯甲桥萘(864)+TX、烯丙菊酯(17)+TX、阿洛氯菌素(别名)[CCN]+TX、除害威(866)+TX、 $\alpha$ -氯氰菊酯(202)+TX、 $\alpha$ -蜕皮激素[CCN](别名)+TX、磷化铝(640)+TX、赛硫磷(870)+TX、硫代酰胺(872)+TX、灭害威(873)+TX、胺吸磷(875)+TX、胺吸磷草酸氢盐(875)+TX、双甲脒(24)+TX、新烟碱(877)+TX、乙基杀扑磷(883)+TX、AVI 382(化合物代码)+TX、AZ 60541(化合物代码)+TX、印楝素(别名)(41)+TX、甲基吡啶磷(42)+TX、谷硫磷-乙基(44)+TX、谷硫磷-甲基(45)+TX、偶氮磷(889)+TX、苏云金芽孢杆菌 $\delta$ 内毒素类(别名)(52)+TX、六氟硅酸钡(别名)[CCN]+TX、多硫化钡(IUPAC/化学文摘名称)(892)+TX、熏菊酯[CCN]+TX、Bayer 22/190(研究代码)(893)+TX、Bayer 22408(研究代码)(894)+TX、噁虫威(58)+TX、丙硫克百威(60)+TX、杀虫磺(66)+TX、 $\beta$ 氟氯氰菊酯(194)+TX、 $\beta$ -氯氰菊酯(203)+TX、联苯菊酯(76)+TX、生物烯丙菊酯(78)+TX、生物烯丙菊酯S-环戊烯基异构体(别名)(79)+TX、戊环苄呋菊酯(bioethanomethrin)[CCN]+TX、生物氯菊酯(908)+TX、除虫菊酯(80)+TX、二(2-氯乙基)醚(IUPAC名称)(909)+TX、双三氟虫脒(83)+TX、硼砂(86)+TX、溴灭菊酯(别名)+TX、溴苯烯磷(914)+TX、溴杀烯(918)+TX、溴-DDT(别名)[CCN]+TX、溴硫磷(920)+TX、溴硫磷-乙基(921)+TX、合杀威(924)+TX、噻嗪酮(99)+TX、畜虫威(926)+TX、脱甲基丁噻啉磷(butathiofos)(927)+TX、丁酮威(103)+TX、丁酯磷(932)+TX、丁酮砒威(104)+TX、丁基吡啶灵(别名)+TX、硫线磷(109)+TX、砷酸钙[CCN]+TX、氰化钙(444)+TX、多硫化钙(IUPAC名称)(111)+TX、毒杀芬(941)+TX、氯灭杀威(943)+TX、甲萘威(115)+TX、克百威(118)+TX、二硫化碳(IUPAC/化学文摘名称)(945)+TX、四氯化碳(IUPAC名称)(946)+TX、三硫磷(947)+TX、丁硫克百威(119)+TX、杀螟丹(123)+TX、杀螟丹盐酸盐(123)+TX、西伐丁(别名)(725)+TX、冰片丹(960)+TX、氯

丹(128)+TX、开蓬(963)+TX、杀虫脒(964)+TX、杀虫脒盐酸盐(964)+TX、氯氧磷(129)+TX、溴虫腈(130)+TX、毒虫畏(131)+TX、定虫隆(132)+TX、氯甲磷(136)+TX、氯仿[CCN]+TX、三氯硝基甲烷(141)+TX、氯辛硫磷(989)+TX、灭虫吡啶(990)+TX、毒死蜱(145)+TX、毒死蜱-甲基(146)+TX、虫螨磷(994)+TX、环虫酰肼(150)+TX、灰菊素I(696)+TX、灰菊素II(696)+TX、灰菊素类(696)+TX、顺式苄呋菊酯(cis-resmethrin)(别名)+TX、顺式苄呋菊酯(cismethrin)(80)+TX、功夫菊酯(别名)+TX、除线威(999)+TX、氯氰碘柳胺(别名)[CCN]+TX、噻虫胺(165)+TX、乙酰亚砷酸铜[CCN]+TX、砷酸铜[CCN]+TX、油酸铜[CCN]+TX、蝇毒磷(174)+TX、畜虫磷(1006)+TX、克罗米通(别名)[CCN]+TX、巴毒磷(1010)+TX、克芦磷酯(1011)+TX、冰晶石(别名)(177)+TX、CS 708(研究代码)(1012)+TX、苯腈膈(1019)+TX、杀螟睛(184)+TX、果虫磷(1020)+TX、环虫菊酯[CCN]+TX、乙氰菊酯(188)+TX、氟氯氰菊酯(193)+TX、三氯氟氰菊酯(196)+TX、氯氰菊酯(201)+TX、苯氰菊酯(206)+TX、环丙马秦(209)+TX、畜蜚磷(别名)[CCN]+TX、d-柠檬烯(别名)[CCN]+TX、d-四甲菊酯(别名)(788)+TX、DAEP(1031)+TX、棉隆(216)+TX、DDT(219)+TX、单甲基克百威(decarbofuran)(1034)+TX、溴氰菊酯(223)+TX、田乐磷(1037)+TX、田乐磷-0(1037)+TX、田乐磷-S(1037)+TX、内吸磷(1038)+TX、内吸磷-甲基(224)+TX、内吸磷-0(1038)+TX、内吸磷-0-甲基(224)+TX、内吸磷-S(1038)+TX、内吸磷-S-甲基(224)+TX、内吸磷-S-甲基砒(1039)+TX、丁醚脒(226)+TX、氯亚胺硫磷(1042)+TX、二胺磷(1044)+TX、二嗪磷(227)+TX、异氯磷(1050)+TX、除线磷(1051)+TX、敌敌畏(236)+TX、迪克力弗斯(dicliphos)(别名)+TX、迪克莱赛尔(dicresyl)(别名)[CCN]+TX、百治磷(243)+TX、地昔尼尔(244)+TX、狄氏剂(1070)+TX、二乙基5-甲基吡啶-3-基磷酸酯(IUPAC名称)(1076)+TX、除虫脒(250)+TX、二羟丙茶碱(dilor)(别名)[CCN]+TX、四氟甲醚菊酯[CCN]+TX、甲氟磷(1081)+TX、地麦威(1085)+TX、乐果(262)+TX、苄菊酯(1083)+TX、甲基毒虫畏(265)+TX、敌蝇威(1086)+TX、消螨酚(1089)+TX、消螨酚(dinex-diclexine)(1089)+TX、丙硝酚(1093)+TX、戊硝酚(1094)+TX、达诺杀(1095)+TX、呋虫胺(271)+TX、苯虫醚(1099)+TX、蔬果磷(1100)+TX、二氧威(1101)+TX、敌恶磷(1102)+TX、乙拌磷(278)+TX、苯噻乙双硫磷(dithicrofos)(1108)+TX、DNOC(282)+TX、多拉克汀(别名)[CCN]+TX、DSP(1115)+TX、蜕皮激素(别名)[CCN]+TX、EI 1642(研究代码)(1118)+TX、甲氧基阿维菌素(291)+TX、甲氧基阿维菌素苯甲酸盐(291)+TX、EMPC(1120)+TX、烯炔菊酯(292)+TX、硫丹(294)+TX、因毒磷(1121)+TX、异狄氏剂(1122)+TX、EPBP(1123)+TX、EPN(297)+TX、保幼醚(1124)+TX、依立诺克丁(别名)[CCN]+TX、高氰戊菊酯(302)+TX、牛津郡丙硫磷(etaphos)(别名)[CCN]+TX、乙硫苯威(308)+TX、乙硫磷(309)+TX、乙虫腈(310)+TX、益硫磷-甲基(1134)+TX、灭线磷(312)+TX、甲酸乙酯(IUPAC名称)[CCN]+TX、乙基-DDD(别名)(1056)+TX、二溴化乙烯(316)+TX、二氯化乙烯(化学名称)(1136)+TX、环氧乙烷[CCN]+TX、醚菊酯(319)+TX、乙嘧硫磷(1142)+TX、EXD(1143)+TX、氨磺磷(323)+TX、苯线磷(326)+TX、抗螨唑(1147)+TX、皮蝇磷(1148)+TX、苯硫威(1149)+TX、芬氟司林(1150)+TX、杀螟硫磷(335)+TX、丁苯威(336)+TX、噻酰虫胺(fenoxacrim)(1153)+TX、苯氧威(340)+TX、吡氯氰菊酯(1155)+TX、甲氰菊酯(342)+TX、吡螨胺(fenpyrad)(别名)+TX、丰索磷(1158)+TX、倍硫磷(346)+TX、倍硫磷-乙基[CCN]+TX、氰戊菊酯(349)+TX、氟虫腈(354)+TX、氟啶虫酰胺(358)+TX、氟虫酰胺(CAS登记号:272451-65-7)+TX、伏康脒(flucufuron)(1168)+TX、氟环脒(366)+TX、氟氰戊菊酯(367)+TX、联氟螨(1169)+TX、噻虫胺[CCN]+TX、氟虫脒(370)+TX、三氟醚菊酯(1171)+TX、氟氯苯菊酯(372)+

TX、氟胺氰菊酯(1184)+TX、FMC 1137(研究代码)(1185)+TX、地虫磷(1191)+TX、伐虫脒(405)+TX、伐虫脒盐酸盐(405)+TX、安硫磷(1192)+TX、藻螨威(formparanate)(1193)+TX、丁苯硫磷(1194)+TX、福司吡酯(1195)+TX、噻唑酮磷(408)+TX、丁硫环磷(1196)+TX、呋线威(412)+TX、抗虫菊(1200)+TX、 $\gamma$ -氯氟氰菊酯(197)+TX、 $\gamma$ -HCH(430)+TX、双胍盐(422)+TX、双胍醋酸盐(422)+TX、GY-81(研究代码)(423)+TX、苜蓿醚(424)+TX、氯虫酰肼(425)+TX、HCH(430)+TX、HEOD(1070)+TX、飞布达(1211)+TX、庚烯磷(432)+TX、速杀硫磷[CCN]+TX、氟铃脒(439)+TX、HHDN(864)+TX、氟蚁腓(443)+TX、氢氰酸(444)+TX、烯虫乙酯(445)+TX、海驱威(hyquincarb)(1223)+TX、吡虫啉(458)+TX、呋咪菊酯(460)+TX、茚虫威(465)+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、IPSP(1229)+TX、氯唑磷(1231)+TX、碳氯灵(1232)+TX、水胺硫磷(别名)(473)+TX、异艾氏剂(1235)+TX、异柳磷(1236)+TX、移栽灵(1237)+TX、异丙威(472)+TX、O-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸异丙酯(IUPAC名称)(473)+TX、稻瘟灵(474)+TX、异拌磷(1244)+TX、恶唑磷(480)+TX、伊维菌素(别名)[CCN]+TX、茚酮菊素I(696)+TX、茚酮菊素II(696)+TX、碘硫磷(1248)+TX、保幼激素I(别名)[CCN]+TX、保幼激素II(别名)[CCN]+TX、保幼激素III(别名)[CCN]+TX、氯戊环(1249)+TX、烯虫炔酯(484)+TX、 $\lambda$ -氯氟氰菊酯(198)+TX、砷酸铅[CCN]+TX、雷皮菌素(CCN)+TX、对溴磷(1250)+TX、林旦(430)+TX、丙噻硫磷(lirimfos)(1251)+TX、虱螨脒(490)+TX、噻唑磷(1253)+TX、间异丙基苯基甲基氨基甲酸酯(IUPAC名称)(1014)+TX、磷化镁(IUPAC名称)(640)+TX、马拉硫磷(492)+TX、特螨脒(1254)+TX、叠氮磷(1255)+TX、灭蚜磷(502)+TX、四甲磷(1258)+TX、灭蚜硫磷(1260)+TX、地安磷(1261)+TX、氯化亚汞(513)+TX、线虫灵(mesulfenfos)(1263)+TX、氰氟虫腓(CCN)+TX、威百亩(519)+TX、威百亩钾(别名)(519)+TX、威百亩钠(519)+TX、虫螨畏(1266)+TX、甲胺磷(527)+TX、甲烷磺酰氟(IUPAC/化学文摘名称)(1268)+TX、杀扑磷(529)+TX、灭虫威(530)+TX、杀虫乙烯磷(1273)+TX、灭多威(531)+TX、烯虫酯(532)+TX、甲啶丁(1276)+TX、甲醚菊酯(别名)(533)+TX、甲氧滴滴涕(534)+TX、甲氧苯酰(535)+TX、溴甲烷(537)+TX、异硫氰酸甲酯(543)+TX、甲基氯仿(别名)[CCN]+TX、二氯甲烷[CCN]+TX、甲氧苄氟菊酯[CCN]+TX、速灭威(550)+TX、恶虫酮(1288)+TX、速灭磷(556)+TX、兹克威(1290)+TX、密灭汀(557)+TX、米尔倍霉素(别名)[CCN]+TX、丙胺氟磷(1293)+TX、灭蚁灵(1294)+TX、久效磷(561)+TX、茂硫磷(1300)+TX、莫昔克丁(别名)[CCN]+TX、萘酞磷(别名)[CCN]+TX、二溴磷(567)+TX、萘(IUPAC/化学文摘名称)(1303)+TX、NC-170(研究代码)(1306)+TX、NC-184(化合物代码)+TX、烟碱(578)+TX、硫酸烟碱(578)+TX、氟蚁灵(1309)+TX、烯啶虫胺(579)+TX、硝乙脲噻唑(nithiazine)(1311)+TX、戊氰威(1313)+TX、戊氰威1:1氯化锌络合物(1313)+TX、NNI-0101(化合物代码)+TX、NNI-0250(化合物代码)+TX、降烟碱(传统名称)(1319)+TX、双苯氟脒(585)+TX、多氟脒(586)+TX、O-5-二氯-4-碘苯基O-乙基乙基硫代膦酸酯(IUPAC名称)(1057)+TX、O,0-二乙基O-4-甲基-2-氧代-2H-色烯-7-基硫代膦酸酯(IUPAC名称)(1074)+TX、O,0-二乙基O-6-甲基-2-丙基嘧啶-4-基硫代膦酸酯(IUPAC名称)(1075)+TX、O,0,0',0'-四丙基二硫代焦磷酸酯(IUPAC名称)(1424)+TX、油酸(IUPAC名称)(593)+TX、氧化乐果(594)+TX、杀线威(602)+TX、砒吸磷-甲基(609)+TX、异亚砒磷(1324)+TX、砒拌磷(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、对-二氯苯[CCN]+TX、对硫磷(615)+TX、对硫磷-甲基(616)+TX、氟幼脒(别名)[CCN]+TX、五氯苯酚(623)+TX、月桂酸五氯苯基酯(IUPAC名称)(623)+TX、氯菊酯(626)+TX、石油油料类(别名)(628)+TX、PH 60-38(研究代码)(1328)+TX、芬硫磷(1330)+



TX、苯醚菊酯 (630) +TX、稻丰散 (631) +TX、甲拌磷 (636) +TX、伏杀硫磷 (637) +TX、硫环磷 (1338) +TX、亚胺硫磷 (638) +TX、对氯硫磷 (1339) +TX、磷胺 (639) +TX、磷化氢 (IUPAC 名称) (640) +TX、辛硫磷 (642) +TX、辛硫磷-甲基 (1340) +TX、甲胺基嘧啶磷 (pirimetaphos) (1344) +TX、抗蚜威 (651) +TX、乙基基嘧啶磷 (1345) +TX、甲基嘧啶磷 (652) +TX、聚氯二环戊二烯异构体类 (IUPAC 名称) (1346) +TX、聚氯萘类 (传统名称) (1347) +TX、亚砷酸钾 [CCN] +TX、硫氰酸钾 [CCN] +TX、丙炔菊酯 (655) +TX、早熟素 I (别名) [CCN] +TX、早熟素 II (别名) [CCN] +TX、早熟素 III (别名) [CCN] +TX、乙酰嘧啶磷 (primidophos) (1349) +TX、丙溴磷 (662) +TX、丙氟菊酯 [CCN] +TX、蜚虱威 (1354) +TX、猛杀威 (1355) +TX、丙虫磷 (1356) +TX、胺丙畏 (673) +TX、残杀威 (678) +TX、乙噻唑磷 (1360) +TX、丙硫磷 (686) +TX、发硫磷 (1362) +TX、丙苯炔菊酯 (protrifenbute) [CCN] +TX、吡蚜酮 (688) +TX、吡唑硫磷 (689) +TX、定菌磷 (693) +TX、苄呋菊酯 (pyresmethrin) (1367) +TX、除虫菊酯 I (696) +TX、除虫菊酯 II (696) +TX、除虫菊酯类 (696) +TX、哒螨灵 (699) +TX、啉虫丙醚 (700) +TX、哒嗪硫磷 (701) +TX、嘧螨醚 (706) +TX、嘧硫磷 (1370) +TX、吡丙醚 (708) +TX、苦木提取物 (quassia) (别名) [CCN] +TX、喹硫磷 (quinalphos) (711) +TX、喹硫磷-甲基 (1376) +TX、畜宁磷 (1380) +TX、喹硫磷 (quintiofos) (1381) +TX、R-1492 (研究代码) (1382) +TX、雷复尼特 (别名) [CCN] +TX、苄呋菊酯 (719) +TX、鱼藤酮 (722) +TX、RU 15525 (研究代码) (723) +TX、RU25475 (研究代码) (1386) +TX、尼亚那 (ryania) (别名) (1387) +TX、利阿诺定 (传统名称) (1387) +TX、沙巴藜芦 (别名) (725) +TX、八甲磷 (1389) +TX、硫线磷 (别名) +TX、塞拉菌素 (别名) [CCN] +TX、SI-0009 (化合物代码) +TX、SI-0205 (化合物代码) +TX、SI-0404 (化合物代码) +TX、SI-0405 (化合物代码) +TX、氟硅菊酯 (728) +TX、SN 72129 (研究代码) (1397) +TX、亚砷酸钠 [CCN] +TX、氰化钠 (444) +TX、氟化钠 (IUPAC/化学文摘名称) (1399) +TX、六氟硅酸钠 (1400) +TX、五氯酚钠 (623) +TX、硒酸钠 (IUPAC 名称) (1401) +TX、硫氰酸钠 [CCN] +TX、苏硫磷 (1402) +TX、多杀菌素 (737) +TX、螺甲螨酯 (739) +TX、螺虫乙酯 (CCN) +TX、萨尔科福隆 (sulcofuron) (746) +TX、萨尔科福隆钠 (sulcofuron-sodium) (746) +TX、氟虫胺 (750) +TX、治螟磷 (753) +TX、磺酰氟 (756) +TX、硫丙磷 (1408) +TX、焦油类 (别名) (758) +TX、 $\tau$ -氟胺氰菊酯 (398) +TX、噻螨威 (1412) +TX、TDE (1414) +TX、虫酰肼 (762) +TX、吡螨胺 (763) +TX、丁基嘧啶磷 (764) +TX、氟苯脲 (768) +TX、七氟菊酯 (769) +TX、双硫磷 (770) +TX、TEPP (1417) +TX、环戊烯丙菊酯 (1418) +TX、叔丁威 (terbam) (别名) +TX、特丁硫磷 (773) +TX、四氯乙烷 [CCN] +TX、杀虫畏 (777) +TX、四甲菊酯 (787) +TX、 $\theta$ 氯氰菊酯 (204) +TX、噻虫啉 (791) +TX、塞芬诺克斯 (thiafenox) (别名) +TX、噻虫嗪 (792) +TX、苯噻硫磷 (thicrofos) (1428) +TX、克虫威 (1431) +TX、杀虫环 (798) +TX、杀虫环草酸氢盐 (798) +TX、硫双威 (799) +TX、久效威 (800) +TX、甲基乙拌磷 (801) +TX、虫线磷 (1434) +TX、杀虫单 (thiosultap) (803) +TX、杀虫双 (thiosultap-sodium) (803) +TX、苏云金素 (别名) [CCN] +TX、啉虫酰胺 (809) +TX、四溴菊酯 (812) +TX、四氟苯菊酯 (813) +TX、反式苄氯菊酯 (transpermethrin) (1440) +TX、威菌磷 (1441) +TX、唑蚜威 (818) +TX、三唑磷 (820) +TX、唑呀威 (别名) +TX、敌百虫 (824) +TX、三氯偏磷酸-3 (trichlormetaphos-3) (别名) [CCN] +TX、毒壤磷 (1452) +TX、三氯丙氧磷 (1455) +TX、杀铃脲 (835) +TX、混杀威 (840) +TX、烯虫硫酯 (1459) +TX、蚜灭磷 (847) +TX、甲烯氟虫腈 (vaniliprole) [CCN] +TX、藜芦定 (别名) (725) +TX、藜芦碱 (别名) (725) +TX、XMC (853) +TX、灭杀威 (854) +TX、YI-5302 (化合物代码) +TX、 $\zeta$ -氯氰菊酯 (205) +TX、泽塔米林 (zetamethrin) (别名) +TX、磷化锌 (640) +TX、丙硫恶唑磷

(zolaprofos) (1469) 以及 ZXI 8901 (研究代码) (858) +TX、氰虫酰胺 [736994-63-19] +TX、氯虫酰胺 [500008-45-7] +TX、啉啉氰 (cyenopyrafen) [560121-52-0] +TX、丁氟螨酯 [400882-07-7] +TX、氟虫吡啶 (pyrifluquinazon) [337458-27-2] +TX、乙基多杀菌素 (spinetoram) [187166-40-1+187166-15-0] +TX、螺虫乙酯 [203313-25-1] +TX、虱虫啉 (sulfoxaflo) [946578-00-3] +TX、丁虫腈 (flufiprole) [704886-18-0] +TX、氯氟醚菊酯 [915288-13-0] +TX、四氟醚菊酯 (tetramethylfluthrin) [84937-88-2] +TX、triflumezopyrim (披露于 W0 2012/092115 中) +TX、fluxametamide (W0 2007/026965) +TX、epsilon-甲氧苄氟菊酯 [240494-71-7] +TX、epsilon-momfluorothrin [1065124-65-3] +TX、fluazaindolizine [1254304-22-7] +TX、氯碱丙炔菊酯 [399572-87-3] +TX、fluxametamide [928783-29-3] +TX、cyhalodiamide [1262605-53-7] +TX、tioazafen [330459-31-9] +TX、broflanilide [1207727-04-5] +TX、丁烯氟虫腈 (flufiprole) [704886-18-0] +TX、环溴虫酰胺 [1031756-98-5] +TX、氟氰虫酰胺 [1229654-66-3] +TX、戊吡虫胍 (描述于 W0 2010/060231 中) +TX、环氧虫啉 (描述于 W0 2005/077934 中) +TX

[0642] 杀软体动物剂, 该杀软体动物剂选自以下物质组成的组: 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 (cloethocarb) (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、氯硝柳胺乙醇胺盐 (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、杀螺吗啉 (trifenmorph) (1454) +TX、混杀威 (trimethacarb) (840) +TX、乙酸三苯基锡 (IUPAC 名称) (347) 和三苯基氢氧化锡 (IUPAC 名称) (347) +TX、皮瑞普 (pyriprole) [394730-71-3] +TX,

[0643] 杀线虫剂, 该杀线虫剂选自以下物质组成的组: AKD-3088 (化合物代码) +TX、1, 2-二溴-3-氯丙烷 (IUPAC/化学文摘名) (1045) +TX、1, 2-二氯丙烷 (IUPAC/化学文摘名) (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) (1065) +TX、3-(4-氯苯基)-5-甲基绕丹宁 (IUPAC 名称) (980) +TX、5-甲基-6-硫代-1, 3, 5-噻二嗪烷-3-基乙酸 (IUPAC 名称) (1286) +TX、6-异戊烯基氨基嘌呤 (别名) (210) +TX、阿巴美丁 (1) +TX、乙酰虫腈 [CCN] +TX、棉铃威 (15) +TX、涕灭威 (aldicarb) (16) +TX、涕灭砒威 (aldoxycarb) (863) +TX、AZ 60541 (化合物代码) +TX、benclothiaz [CCN] +TX、苯菌灵 (62) +TX、丁基吡啶酮 (butylpyridaben) (别名) +TX、硫线磷 (cadusafos) (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 (cloethocarb) (999) +TX、细胞分裂素 (cytokinins) (别名) (210) +TX、棉隆 (216) +TX、DBCP (1045) +TX、DCIP (218) +TX、除线特 (diamidafos) (1044) +TX、除线磷 (dichlofenthion) (1051) +TX、二克磷 (dicliphos) (别名) +TX、乐果 (262) +TX、多拉克汀 (别名) [CCN] +TX、依马克丁 (291) +TX、依马克丁苯甲酸酯 (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 (fenamiphos) (326) +TX、吡啶胺 (别名) +TX、丰索磷 (fenpyrad) (1158) +TX、噻唑磷 (fosthiazate) (408) +TX、丁硫环磷 (fosthietan) (1196) +TX、糠醛 (别名) [CCN] +TX、GY-81 (研究代码) (423) +TX、速杀硫磷 (heterophos) [CCN] +TX、碘甲烷 (IUPAC 名称) (542) +TX、isamidofos (1230) +TX、氯唑磷 (isazofos) (1231) +TX、伊维菌素 (别名) [CCN] +TX、激动素

(210)+TX、甲基灭蚜磷(mecarphon) (1258)+TX、威百亩(519)+TX、威百亩钾盐(别名)(519)+TX、威百亩钠盐(519)+TX、甲基溴(537)+TX、异硫氰酸甲酯(543)+TX、杀螨菌素脒(milbemycin oxime)(别名)[CCN]+TX、莫昔克丁(别名)[CCN]+TX、疣孢漆斑菌(Myrothecium verrucaria)组分(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(phosphocarb)[CCN]+TX、硫线磷(sebufos)(别名)+TX、塞拉菌素(selamectin)(别名)[CCN]+TX、多杀菌素(737)+TX、叔丁威(terbam)(别名)+TX、特丁磷(terbufos)(773)+TX、四氯噻吩(IUPAC/化学文摘名)(1422)+TX、噻菲农(别名)+TX、虫线磷(thionazin)(1434)+TX、三唑磷(triazophos)(820)+TX、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、fluensulfone [318290-98-1]+TX,

[0644] 硝化作用抑制剂,该硝化作用抑制剂选自由以下物质组成的组:乙基黄原酸钾[CCN]以及氯啉(nitrapyrin)(580)+TX,

[0645] 植物激活剂,该植物激活剂选自由以下物质组成的组:噻二唑素(acibenzolar)(6)+TX、噻二唑素-S-甲基(6)+TX、烯丙苯噻唑(probenazole)(658)和大虎杖(Reynoutria sachalinensis)提取物(别名)(720)+TX,

[0646] 杀鼠剂,该杀鼠剂选自由以下物质组成的组:2-异戊酰茛满-1,3-二酮(IUPAC名称)(1246)+TX、4-(喹啉啉-2-基氨基)苯磺酰胺(IUPAC名称)(748)+TX、 $\alpha$ -氯代醇[CCN]+TX、磷化铝(640)+TX、安妥(880)+TX、三氧化二砷(882)+TX、碳酸钡(891)+TX、双鼠脒(912)+TX、溴鼠隆(89)+TX、溴敌隆(91)+TX、溴鼠胺(92)+TX、氰化钙(444)+TX、氮醛糖(127)+TX、氯鼠酮(140)+TX、维生素D3(别名)(850)+TX、氯灭鼠灵(1004)+TX、克灭鼠(1005)+TX、杀鼠萘(175)+TX、杀鼠啉啉(1009)+TX、鼠得克(246)+TX、噻鼠灵(249)+TX、敌鼠钠(273)+TX、维生素D2(301)+TX、氟鼠灵(357)+TX、氟乙酰胺(379)+TX、鼠朴定(1183)+TX、盐酸鼠朴定(1183)+TX、 $\gamma$ -HCH(430)+TX、HCH(430)+TX、氢氰酸(444)+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、林旦(430)+TX、磷化镁(IUPAC名称)(640)+TX、甲基溴(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,

[0647] 增效剂,该增效剂选自由以下物质组成的组:2-(2-丁氧基乙氧基)乙基胡椒基酯(IUPAC名称)(934)+TX、5-(1,3-苯并二氧杂环戊烯-5-基)-3-己基环己-2-烯酮(IUPAC名称)(903)+TX、具有橙花叔醇的法呢醇(别名)(324)+TX、MB-599(研究代码)(498)+TX、MGK 264(研究代码)(296)+TX、增效醚(piperonyl butoxide)(649)+TX、增效醛(piprotal)(1343)+TX、增效酯(propyl isomer)(1358)+TX、S421(研究代码)(724)+TX、增效散(sesamex)(1393)+TX、芝麻林素(sesasmolin)(1394)和亚砷(1406)+TX,

[0648] 动物驱避剂,该动物驱避剂选自由以下物质组成的组: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、双胍盐(guazatine)(422)+TX、双胍醋酸盐(422)+TX、灭虫威(530)+TX、吡啉-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,

[0649] 杀病毒剂,该杀病毒剂选自由以下物质组成的组:衣马宁(别名)[CCN]和利巴韦林

(别名) [CCN]+TX,

[0650] 创伤保护剂,该创伤保护剂选自由以下物质组成的组:氧化汞(512)+TX、辛噻酮(590)和甲基硫菌灵(802)+TX,

[0651] 以及生物活性化合物,这些化合物选自由以下物质组成的组:阿扎康唑[60207-31-0]+TX、联苯三唑醇[70585-36-3]+TX、糠菌唑[116255-48-2]+TX、环唑醇[94361-06-5]+TX、苯醚甲环唑[119446-68-3]+TX、烯唑醇[83657-24-3]+TX、氟环唑[106325-08-0]+TX、腈苯唑[114369-43-6]+TX、氟唑唑[136426-54-5]+TX、氟硅唑[85509-19-9]+TX、粉唑醇[76674-21-0]+TX、己唑醇[79983-71-4]+TX、抑霉唑[35554-44-0]+TX、亚胺唑[86598-92-7]+TX、种菌唑[125225-28-7]+TX、叶菌唑[125116-23-6]+TX、腈菌唑[88671-89-0]+TX、稻瘟酯[101903-30-4]+TX、戊菌唑[66246-88-6]+TX、丙硫菌唑[178928-70-6]+TX、啉斑肟(pyriphenox)[88283-41-4]+TX、丙氯灵[67747-09-5]+TX、丙环唑[60207-90-1]+TX、硅氟唑(simeconazole)[149508-90-7]+TX、戊唑醇[107534-96-3]+TX、氟醚唑[112281-77-3]+TX、三唑酮[43121-43-3]+TX、三唑酮[55219-65-3]+TX、氟菌唑[99387-89-0]+TX、灭菌唑[131983-72-7]+TX、三环苯嘧啶醇[12771-68-5]+TX、氯苯嘧啶醇[60168-88-9]+TX、氟氯苯嘧啶醇[63284-71-9]+TX、乙嘧酚磺酸酯(bupirimate)[41483-43-6]+TX、甲菌定(dimethirimol)[5221-53-4]+TX、乙菌定(ethirimol)[23947-60-6]+TX、十二环吗啉[1593-77-7]+TX、苯锈啉(fenpropidine)[67306-00-7]+TX、丁苯吗啉[67564-91-4]+TX、螺环菌胺[118134-30-8]+TX、十三吗啉[81412-43-3]+TX、嘧菌环胺[121552-61-2]+TX、嘧菌胺[110235-47-7]+TX、嘧霉胺(pyrimethanil)[53112-28-0]+TX、拌种咯[74738-17-3]+TX、咯菌腈(fludioxonil)[131341-86-1]+TX、苯霜灵(benalaxyl)[71626-11-4]+TX、呋霜灵(furalaxyl)[57646-30-7]+TX、甲霜灵[57837-19-1]+TX、R甲霜灵[70630-17-0]+TX、呋酰胺[58810-48-3]+TX、恶霜灵(Oxadixyl)[77732-09-3]+TX、苯菌灵[17804-35-2]+TX、多菌灵[10605-21-7]+TX、咪菌威(debacarb)[62732-91-6]+TX、麦穗宁[3878-19-1]+TX、噻苯达唑[148-79-8]+TX、乙菌利(chlozolate)[84332-86-5]+TX、菌核利(dichlozoline)[24201-58-9]+TX、异菌脲(Iprodione)[36734-19-7]+TX、mycloclozoline[54864-61-8]+TX、腐霉利(procymidone)[32809-16-8]+TX、乙烯菌核利(vinclozoline)[50471-44-8]+TX、啉酰菌胺(boscalid)[188425-85-6]+TX、萎锈灵[5234-68-4]+TX、甲呋酰胺[24691-80-3]+TX、氟酰胺(Flutolanil)[66332-96-5]+TX、灭锈胺[55814-41-0]+TX、氧化萎锈灵[5259-88-1]+TX、吡噻菌胺(penthiopyrad)[183675-82-3]+TX、噻呋菌胺[130000-40-7]+TX、双胍盐[108173-90-6]+TX、多果定(dodine)[2439-10-3][112-65-2](游离碱)+TX、双胍辛胺(iminoctadine)[13516-27-3]+TX、嘧菌酯[131860-33-8]+TX、醚菌胺[149961-52-4]+TX、烯肟菌酯{Proc.BCPC,Int.Congr.,Glasgow,2003,1,93}+TX、氟嘧菌酯[361377-29-9]+TX、甲基醚菌酯[143390-89-0]+TX、苯氧菌胺[133408-50-1]+TX、肟菌酯[141517-21-7]+TX、肟醚菌胺[248593-16-0]+TX、啉氧菌酯[117428-22-5]+TX、唑菌胺酯[175013-18-0]+TX、福美铁[14484-64-1]+TX、代森锰锌[8018-01-7]+TX、代森锰[12427-38-2]+TX、代森联[9006-42-2]+TX、甲代森锌(propineb)[12071-83-9]+TX、塞仑[137-26-8]+TX、代森锌[12122-67-7]+TX、福美锌[137-30-4]+TX、敌菌丹(captan)[2425-06-1]+TX、克菌丹[133-06-2]+TX、苯氟磺胺[1085-98-9]+TX、唑啉草(fluoroimide)[41205-21-4]+TX、灭菌丹[133-07-3]+TX、甲苯氟磺胺[731-27-1]+TX、波尔多(bordeaux)混合物[8011-63-0]+TX、氢氧化铜

(copperhydroxid) [20427-59-2]+TX、氯化铜(copperoxychlorid) [1332-40-7]+TX、硫酸铜(coppersulfat) [7758-98-7]+TX、氧化铜(copperoxid) [1317-39-1]+TX、代森锰铜(mancopper) [53988-93-5]+TX、喹啉铜(oxine-copper) [10380-28-6]+TX、敌螨普(dinocap) [131-72-6]+TX、酞菌酯(nitrothal-isopropyl) [10552-74-6]+TX、克瘟散[17109-49-8]+TX、异稻瘟净(iprobenphos) [26087-47-8]+TX、稻瘟灵(isoprothiolane) [50512-35-1]+TX、氯瘟磷(phosdiphen) [36519-00-3]+TX、克菌磷(pyrazophos) [13457-18-6]+TX、甲基托氯磷(tolclofos-methyl) [57018-04-9]+TX、苯并噻二唑(acibenzolar-S-methyl) [135158-54-2]+TX、敌菌灵[101-05-3]+TX、苯噻菌胺[413615-35-7]+TX、灭瘟素(blasticidin)-S[2079-00-7]+TX、灭螨猛(chinomethionat) [2439-01-2]+TX、地茂散(chloroneb) [2675-77-6]+TX、百菌清[1897-45-6]+TX、环氟菌胺[180409-60-3]+TX、霜脲氰[57966-95-7]+TX、二氯萘醌(dichlone) [117-80-6]+TX、双氯氰菌胺(diclocymet) [139920-32-4]+TX、哒菌酮(diclomezine) [62865-36-5]+TX、氯硝胺(dicloran) [99-30-9]+TX、乙霉威(diethofencarb) [87130-20-9]+TX、烯酰吗啉[110488-70-5]+TX、SYPLI90(Flumorph) [211867-47-9]+TX、二噻农(dithianon) [3347-22-6]+TX、噻唑菌胺(ethaboxam) [162650-77-3]+TX、土菌灵(etridiazole) [2593-15-9]+TX、恶唑菌酮[131807-57-3]+TX、咪唑菌酮(fenamidone) [161326-34-7]+TX、稻瘟酰胺(Fenoxanil) [115852-48-7]+TX、三苯锡(fentin) [668-34-8]+TX、噻菌胺(ferimzone) [89269-64-7]+TX、氟啶胺(fluazinam) [79622-59-6]+TX、氟吡菌胺(fluopicolide) [239110-15-7]+TX、磺菌胺(flusulfamide) [106917-52-6]+TX、环酰菌胺[126833-17-8]+TX、福赛得(fosetyl-aluminium) [39148-24-8]+TX、恶霉灵(hymexazol) [10004-44-1]+TX、丙森锌[140923-17-7]+TX、IKF916(赛座灭(Cyazofamid)) [120116-88-3]+TX、春雷霉素(kasugamycin) [6980-18-3]+TX、磺菌威(methasulfocarb) [66952-49-6]+TX、苯菌酮[220899-03-6]+TX、戊菌隆(pencycuron) [66063-05-6]+TX、苯酞[27355-22-2]+TX、多氧霉素(polyoxins) [11113-80-7]+TX、噻菌灵(probenazole) [27605-76-1]+TX、百维威(propamocarb) [25606-41-1]+TX、碘啶唑酮(proquinazid) [189278-12-4]+TX、乐喹酮(pyroquilon) [57369-32-1]+TX、噻氧灵[124495-18-7]+TX、五氯硝苯[82-68-8]+TX、硫[7704-34-9]+TX、噻酰菌胺[223580-51-6]+TX、咪唑嗪(triazoxide) [72459-58-6]+TX、三环唑[41814-78-2]+TX、噻氨灵[26644-46-2]+TX、有效霉素[37248-47-8]+TX、苯酰菌胺(zoxamide) (RH7281) [156052-68-5]+TX、双炔酰菌胺(mandipropamid) [374726-62-2]+TX、吡蚜酮(isopyrazam) [881685-58-1]+TX、塞德因(sedaxane) [874967-67-6]+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸(9-二氯亚甲基-1,2,3,4-四氢-1,4-桥亚甲基-萘-5-基)-酰胺(披露于WO 2007/048556中)+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸(3',4',5'-三氟-联苯基-2-基)-酰胺(披露于WO 2006/087343中)+TX、[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[(环丙基羰基)氧基]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氢-6,12-二羟基-4,6a,12b-三甲基-11-氧代-9-(3-吡啶基)-2H,11H萘并[2,1-b]吡喃并[3,4-e]吡喃-4-基]甲基-环丙甲酸酯[915972-17-7]+TX以及1,3,5-三甲基-N-(2-甲基-1-氧丙基)-N-[3-(2-甲基丙基)-4-[2,2,2-三氟-1-甲氧基-1-(三氟甲基)乙基]苯基]-1H-吡唑-4-甲酰胺[926914-55-8]+TX、兰蔻三酮(lancotriene) [1486617-21-3]+TX、氯氟吡啶酯[943832-81-3]+TX、艾分氟康唑(ipfentrifluconazole) [1417782-08-1]+TX、氯氟醚菌唑(mefentrifluconazole) [1417782-03-6]+TX、

quinofumelin[861647-84-9]+TX、右旋反式氯丙炔菊酯(chloroprallethrin) [399572-87-3]+TX、氯氟氰虫酰胺(cyhalodiamide) [1262605-53-7]+TX、三氟咪啉酰胺(fluzaindolizine) [1254304-22-7]+TX、fluxametamide[928783-29-3]+TX、ε-甲氧苄氟菊酯[240494-71-7]+TX、ε-氟氯氰菊酯(epsilon-momfluorothrin) [1065124-65-3]+TX、氟唑菌酰胺[1228284-64-7]+TX、κ-毕芬宁(kappa-bifenthrin) [439680-76-9]+TX、溴虫氟苯双酰胺(broflanilide) [1207727-04-5]+TX、敌克美施(dicloromezotiaz) [1263629-39-5]+TX、敌派美创(dipymetitrone) [16114-35-5]+TX、吡唑嘧啉(pyraziflumid) [942515-63-1]+TX、κ-七氟菊酯(kappa-tefluthrin) [391634-71-2]+TX、制定杀(fenpicoxamid) [517875-34-2]+TX、氟茚唑菌胺(fluindapyr) [1383809-87-7]+TX、α-溴敌隆(alpha-bromadiolone) [28772-56-7]+TX、flupyrimin[1689566-03-7]+TX、benzpyrimoxan [1449021-97-9]+TX、acynonapyr[1332838-17-1]+TX、inpyrfluxam[1352994-67-2]+TX、isoflucypram[1255734-28-1]+TX、tyclopiazoflor[64309-03-1]+TX、spiropidion [1531626-08-0]+TX、tyclopiazoflor[1477919-27-9]+TX、以及spiropidion[1229023-00-0]+TX、以及

[0652] 微生物剂,包括:鲁氏不动杆菌+TX、交替枝顶孢(Acremonium alternatum)+TX+TX、顶头孢霉(Acremonium cephalosporium)+TX+TX、Acremonium diospyri+TX、Acremonium obclavatum+TX、棉褐带卷蛾颗粒体病毒(AdoxGV) (**Capex®**)+TX、放射形土壤杆菌菌株K84(**Galltrol-A®**)+TX、互隔链格孢+TX、决明链格孢(Alternaria cassia)+TX、损毁链格孢(**Smolder®**)+TX、白粉寄生孢(**AQ10®**)+TX、黄曲霉AF36(**AF36®**)+TX、黄曲霉NRRL21882(**Aflaguard®**)+TX、曲霉属+TX、出芽短梗霉+TX、固氮螺菌属+TX、(**MicroAZ®**+TX、TAZO **B®**)+TX、固氮菌属+TX、圆褐固氮菌(**Azotomeal®**)+TX、孢囊固氮菌(Bionatural Blooming **Blossoms®**)+TX、解淀粉芽孢杆菌+TX、蜡样芽孢杆菌+TX、原生祛病芽孢杆菌(Bacillus chitinosporus) 菌株CM-1+TX、原生祛病芽孢杆菌菌株AQ746+TX、地衣芽孢杆菌菌株HB-2(Biostart™ **Rhizoboost®**)+TX、地衣芽孢杆菌菌株3086(**EcoGuard®**+TX、Green**Releaf®**)+TX、环状芽孢杆菌+TX、坚硬芽孢杆菌(**BioSafe®**+TX、**BioNem-WP®**+TX、**VOTiVO®**)+TX、坚硬芽孢杆菌菌株I-1582+TX、浸麻芽孢杆菌+TX、Bacillus marismortui+TX、巨大芽孢杆菌+TX、蕈状芽孢杆菌菌株AQ726+TX、日本甲虫芽孢杆菌(Milky Spore **Powder®**)+TX、短小芽孢杆菌属+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(**VectoLex®**)+TX、芽孢杆菌属+TX、芽孢杆菌属菌株AQ175+TX、芽孢杆菌属菌株AQ177+TX、芽孢杆菌属菌株AQ178+TX、枯草芽孢杆菌菌株QST 713(**CEASE®**+TX、**Serenade®**+TX、**Rhapsody®**)+TX、枯草芽孢杆菌菌株QST 714(**JAZZ®**)+TX、枯草芽孢杆菌菌株AQ153+TX、枯草芽孢杆菌菌株AQ743+TX、枯草芽孢杆菌菌株QST3002+TX、枯草芽孢杆菌菌株QST3004+TX、枯草芽孢杆菌解淀粉变种

菌株FZB24 (**Taegro®**+TX、**Rhizopro®**)+TX、苏云金芽孢杆菌Cry 2Ae+TX、苏云金芽孢杆菌Cry1Ab+TX、苏云金芽孢杆菌鮎泽亚种 (*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BD#32+TX、苏云金芽孢杆菌菌株AQ52+TX、苏云金芽孢杆菌鮎泽变种 (**XenTari®**+TX、**DiPel®**)+TX、细菌属 (**GROWMEND®**+TX、**GROWSWEET®**+TX、**Shootup®**)+TX、密执安棍状杆菌 (*Clavipacter michiganensis*) 的噬菌体 (**AgriPhage®**)+TX、**Bakflor®**+TX、球孢白僵菌 (**Beaugenic®**+TX、**Brocaril WP®**)+TX、球孢白僵菌GHA (Mycotrol **ES®**+TX、Mycotrol **O®**+TX、**BotaniGuard®**)+TX、布氏白僵菌 (**Engerlingspilz®**+TX、Schweizer **Beauveria®**+TX、**Melocont®**)+TX、白僵菌属+TX、灰葡萄孢霉+TX、大豆慢生型根瘤菌 (**TerraMax®**)+TX、短短小芽孢杆菌+TX、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种 (*Bacillus thuringiensis tenebrionis*) (**Novodor®**)+TX、BtBooster+TX、洋葱伯克霍尔德菌 (**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+TX、伯克霍尔德菌属+TX、加拿大蓍真菌 (CBH Canadian **Bioherbicide®**)+TX、奶酪假丝酵母+TX、无名假丝酵母+TX、*Candida fructus*+TX、光滑念珠菌+TX、吉利蒙念珠菌 (*Candida guilliermondii*) +TX、口津假丝酵母+TX、橄榄假丝酵母菌株O+TX、近平滑假丝酵母+TX、菌膜假丝酵母+TX、铁红假丝酵母+TX、拉考夫假丝酵母 (*Candida reukaufii*) +TX、齐藤假丝酵母 (*Candida saitoana*) (**Bio-Coat®**+TX、**Biocure®**)+TX、清酒假丝酵母+TX、假丝酵母属+TX、纤细假丝酵母+TX、戴氏西地西菌 (*Cedecea dravisae*) +TX、产黄纤维单胞菌+TX、螺旋毛壳 (**Nova-Cide®**)+TX、球毛壳菌 (**Nova-Cide®**)+TX、铁杉紫色杆菌 (*Chromobacterium subtsugae*) 菌株PRAA4-1T (**Grandevo®**)+TX、枝状枝孢菌+TX、尖孢枝孢+TX、*Cladosporium chlorocephalum*+TX、枝孢属+TX、极细枝孢霉+TX、粉红粘帚霉 (**EndoFine®**)+TX、尖孢炭疽菌 (*Colletotrichum acutatum*) +TX、盾壳霉 (*Cotans WG®*)+TX、盾壳霉属+TX、浅白隐球酵母 (**YIELDPLUS®**)+TX、土生隐球菌+TX、*Cryptococcus infirmo-miniatus*+TX、罗伦隐球酵母+TX、苹果异形小卷蛾颗粒体病毒 (**Cryptex®**)+TX、坎平贪铜菌 (*Cupriavidus campinensis*) +TX、苹果蠹蛾颗粒体病毒

(**CYD-X®**)+TX、苹果蠹蛾颗粒体病毒 (**Madex®**+TX、**Madex Plus®**+TX、**Madex Max/Carповirusine®**)+TX、*Cylindrobasidium laeve* (**Stumpout®**)+TX、枝双孢霉属+TX、*Drechslera hawaiiensis*+TX、阴沟肠杆菌+TX、肠杆菌科+TX、毒力虫霉 (**Vektor®**)+TX、黑附球菌 (*Epicoccum nigrum*)+TX、黑附球菌 (*Epicoccum purpurascens*)+TX、附球菌属+TX、花状线黑粉菌 (*Filobasidium floriforme*)+TX、锐顶镰孢菌+TX、厚垣镰孢霉+TX、尖镰孢 (**Fusaclean®/Biofox C®**)+TX、层生镰孢+TX、镰孢属+TX、溶磷白地霉 (*Galactomyces geotrichum*)+TX、链孢粘帚霉 (**Primastop®**+TX、**Prestop®**)+TX、粉红粘帚霉+TX、粘帚霉属 (**SoilGard®**)+TX、绿色粘帚霉 (**Soilgard®**)+TX、颗粒体病毒属 (**Granupom®**)+TX、嗜盐盐芽孢杆菌 (*Halobacillus halophilus*)+TX、沿岸盐芽孢杆菌 (*Halobacillus litoralis*)+TX、特氏盐芽孢杆菌 (*Halobacillus trueperi*)+TX、盐单胞菌属+TX、冰下盐单胞菌 (*Halomonas subglaciescola*)+TX、盐弧菌变型 (*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、玉米穗虫核型多角体病毒 (**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+TX、大链壶菌 (*Lagenidium giganteum*) (**Laginex®**)+TX、长孢蜡蚧菌 (*Lecanicillium longisporum*) (**Vertiblast®**)+TX、蜡蚧轮枝菌 (*Lecanicillium muscarium*) (**Vertikil®**)+TX、舞毒蛾核多角体病毒 (**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、蓝色小单孢菌 (*Micromonospora coerulea*)+TX、*Microsphaeropsis ochracea*+TX、*Muscodor albus* 620 (**Muscudor®**)+TX、*Muscodor roseus*菌株A3-5+TX、菌根属 (*Mycorrhizae spp.*) (**AMykor®**+TX、**Root Maximizer®**)+TX、疣孢漆斑菌菌株AARC-0255 (**DiTera®**)+TX、**BROS PLUS®**+TX、*Ophiostoma piliferum*菌株D97 (**Sylvanex®**)+TX、粉质拟青霉 (*Paecilomyces farinosus*)+TX、玫烟色拟青霉 (**PFR-97®**+TX、**PreFeRal®**)+TX、淡紫拟青霉 (*Paecilomyces linacinus*) (**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+TX、巴斯德氏芽菌属 (**Econem®**)+TX、*Pasteuria nishizawae*+TX、黄灰青霉+TX、*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+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、*Pichia guiliermondii*+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、荧光假单胞菌菌株A506(**BlightBan A506®**)+TX、恶臭假单胞菌+TX、*Pseudomonas reactans*+TX、假单胞菌属+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* (W0 od **Warrior®**)+TX、侧雄腐霉菌(*Pythium paroecandrum*)+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+TX、根瘤菌(**Dormal®**+TX、**Vault®**)+TX、丝核菌属+TX、球状红球菌菌株AQ719+TX、双倒卵形红冬孢酵母菌(*Rhodosporidium diobovatum*)+TX、圆红冬孢酵母菌+TX、红酵母属+TX、粘红酵母+TX、禾本红酵母+TX、胶红酵母(*Rhodotorula mucilagnosa*)+TX、深红酵母+TX、酿酒酵母+TX、玫瑰色盐水球菌(*Salinococcus roseus*)+TX、小核盘菌+TX、小核盘菌(**SARRITOR®**)+TX、柱顶孢霉属+TX、*Scytalidium uredinicola*+TX、甜菜夜蛾核型多角体病毒(**Spod-X®**+TX、**Spexit®**)+TX、粘质沙雷氏菌+TX、普城沙雷菌+TX、沙雷氏菌属+TX、粪生粪壳菌+TX、海灰翅夜蛾核型多角体病毒(**Littovir®**)+TX、红掷孢酵母+TX、嗜麦芽寡养单胞菌+TX、不吸水链霉菌+TX、白丘链霉菌(*Streptomyces albaduncus*)+TX、脱叶链霉菌+TX、鲜黄链霉菌+TX、灰平链霉菌+TX、灰绿链霉菌(**Mycostop®**)+TX、利迪链霉菌(**Actinovate®**)+TX、利迪链霉菌WYEC-108(**ActinoGrow®**)+TX、紫色链霉菌+TX、小铁艾酵母(*Tilletiopsis minor*)+TX、铁艾酵母属+TX、棘孢木霉(T34 **Biocontrol®**)+TX、盖姆斯木霉(*Trichoderma gamsii*) (**Tenet®**)+TX、深绿木霉(**Plantmate®**)+TX、钩状木霉TH 382+TX、里法哈茨木霉(*Trichoderma harzianum* rifai) (**Mycostar®**)+TX、哈茨木霉T-22(**Trianum-P®**)+TX、PlantShield **HC®**+TX、**RootShield®**+TX、**Trianum-G®**)+TX、哈茨木霉T-39(**Trichodex®**)+TX、非钩木霉(*Trichoderma inhamatum*)+TX、康宁木霉+TX、木霉属LC 52(**Sentinel®**)+TX、木素木霉+TX、长柄木霉+TX、多孢木霉(*Trichoderma polysporum*) (**BinabT®**)+TX、紫杉木霉+TX、绿色木霉+TX、绿色木霉(原来称为绿色粘帚霉GL-21) (**SoilGuard®**)+TX、绿色木霉+TX、绿色木霉菌株ICC 080(**Remedier®**)+TX、茁芽丝孢酵母+TX、毛孢子菌属+TX、单端孢属+TX、粉红单端孢+TX、*Typhula phacorrhiza*菌株94670+TX、*Typhula phacorrhiza*菌株94671+TX、黑细基格孢+TX、奥德曼细基格孢(*Ulocladium oudemansii*) (**Botry-Zen®**)+TX、玉蜀黍黑粉菌+TX、各种细菌和补充营养素(**Natural II®**)+TX、各

种真菌 (Millennium **Microbes®**) +TX、厚垣轮枝孢菌+TX、蜡蚧轮枝菌 (**Mycotal®**+TX、**Vertalec®**) +TX、Vip3Aa20 (**VIPTera®**) +TX、Virgibacillus marismortui+TX、野油菜黄单胞菌 (*Xanthomonas campestris* pv. Poae) (**Camperico®**) +TX、伯氏致病杆菌+TX、嗜线虫致病杆菌; 以及

[0653] 植物提取物, 包括: 松油 (**Retenol®**) +TX、印楝素 (Plasma Neem **Oil®**+TX、**AzaGuard®**+TX、**MeemAzal®**+TX、**Molt-X®**+TX、植物IGR (**Neemazad®**+TX、**Neemix®**) +TX、菜籽油 (Lilly Miller **Vegol®**) +TX、土荆芥附近荆芥 (*Chenopodium ambrosioides* near *ambrosioides*) (**Requiem®**) +TX、菊花浓汁 (*Chrysanthemum* extract) (**Crisant®**) +TX、提取印楝油 (extract of neem oil) (**Trilogy®**) +TX、唇形科的精油 (**Botania®**) +TX、丁香迷迭香薄荷的提取物和百里香精油 (Garden insect **killer®**) +TX、甜菜碱 (**Greenstim®**) +TX、大蒜+TX、柠檬草精油 (**GreenMatch®**) +TX、印度楝树精油+TX、猫薄荷 (薄荷精油) +TX、荆芥卡塔琳娜州 (*Nepeta catarina*) +TX、尼古丁+Tx、牛至精油 (**MossBuster®**) +TX、胡麻科精油 (**Nematon®**) +TX、除虫菊+TX、皂皮树 (**NemaQ®**) +TX、大虎杖 (*Reynoutria sachalinensis*) (**Regalia®**+TX、**Sakalia®**) +TX、鱼藤酮 (Eco **Roten®**) +TX、芸香料植物提取物 (**Soleo®**) +TX、豆油 (*Ortho* **ecosense®**) +TX、茶树精油 (*Timorex* **Gold®**) +TX、百里香精油+TX、**AGNIQUE®**MMF+TX、**BugOil®**+TX、迷迭香芝麻薄荷百里香和肉桂提取物的混合物 (EF **300®**) +TX、丁香迷迭香和薄荷提取物的混合物 (EF **400®**) +TX、丁香薄荷大蒜油和薄荷的混合物 (Soil **Shot®**) +TX、高岭土 (**Screen®**) +TX、储存葡萄糖的褐藻 (**Laminarin®**) ; 以及

[0654] 信息素, 包括: 黑头火虫信息素 (3M Sprayable Blackheaded FireWorm **Pheromone®**) +TX、鳕鱼蛾信息素 (Codling Moth Pheromone) (派拉蒙分配器 (Paramount dispenser) - (CM) / Isomate **C-Plus®**) +TX、葡萄莓果蛾信息素 (Grape Berry Moth Pheromone) (3M MEC-GBM Sprayable **Pheromone®**) +TX、稻纵卷叶螟性信息素 (Leafroller pheromone) (3M MEC-LR Sprayable **Pheromone®**) +TX、家蝇信息素 (Muscamone) (Snip7 Fly **Bait®**+TX、Starbar Premium Fly **Bait®**) +TX、东方水果蛾信息素 (Oriental Fruit Moth Pheromone) (3M oriental fruit moth sprayable **pheromone®**) +TX、桃树钻信息素 (Peachtree Borer Pheromone) (**Isomate-P®**) +TX、番茄蛾类信息素 (Tomato Pinworm Pheromone) (3M Sprayable **pheromone®**) +TX、衣透斯特粉末 (Entostat powder) (从棕榈树提取) (Exosex **CM®**) +TX、(E+TX, Z+TX, Z)-3+TX、8+TX、11醋酸十四酯+TX、(Z+TX, Z+TX, E)-7+TX、11+TX、13-十六碳三烯醛+TX、(E+TX, Z)-7+Tx、9-十二碳二烯-1-

基乙酸酯+TX、2-甲基-1-丁醇+TX、乙酸钙+TX、**Scenturion®**+TX、**Biolure®**+TX、**Check-Mate®**+TX、紫杉醇；以及

[0655] 宏生物剂,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、安氏钝绥螨 (*Amblyseius andersoni*) (**Anderline®**+TX、**Andersoni-System®**) +TX、加州钝绥螨 (*Amblyseius californicus*) (**Amblyline®**+TX、**Spical®**) +TX、胡瓜钝绥螨 (**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、原缨翅缨小蜂 (*Anagrus atomus*) +TX、暗腹长索跳小蜂 (*Anagyrus fusciventris*) +TX、卡玛长索跳小蜂 (*Anagyrus kamali*) +TX、*Anagyrus loecki*+TX、粉蚧长索跳小蜂 (*Anagyrus 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、科列马·阿布拉小蜂 (*Aphidius colemani*) (**Ahipar®**) +TX、阿尔蚜茧蜂 (**Ervipar®**) +TX、烟蚜茧蜂+TX、桃赤蚜蚜茧蜂 (**Ahipar-M®**) +TX、食蚜瘿蚊 (**Aphidend®**) +TX、食蚜瘿蚊 (**Aphidoline®**) +TX、岭南蚜小蜂+TX、印巴黄金蚜小蜂+TX、蠛卵长尾啮小蜂 (*Aprostocetus hagenowii*) +TX、隐翅虫 (*Atheta coriaria*) (**Staphyline®**) +TX、熊蜂属+TX、欧洲熊蜂 (*Natupol Beehive®*) +TX、欧洲熊蜂 (**Beeline®**+TX、**Tripol®**) +TX、*Cephalonomia stephanoderis*+TX、黑背红瓢虫 (*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、*Cirrospilus quadristriatus*+TX、白星橘啮小蜂 (*Citrostichus phyllocnistoides*) +TX、*Closterocerus chamaeleon*+TX、*Closterocerus*属+TX、*Coccidoxenoides perminutus* (**Planopar®**) +TX、*Coccophagus cowperi*+TX、赖食蚧蚜小蜂 (*Coccophagus lycimnia*) +TX、螟黄足盘绒茧蜂+TX、菜蛾盘绒茧蜂+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+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 (*Eretmoceris eremicus*) (**Enermix®**) +TX、哥德恩  
蚜小蜂 (*Encarsia guadeloupae*) +TX、海地恩蚜小蜂 (*Encarsia haitiensis*) +TX、细扁食蚜  
蝇 (**Syrphidend®**) +TX、*Eretmoceris siphonini* +TX、浆角蚜小蜂 (*Eretmoceris*  
*californicus*) +TX、浆角蚜小蜂 (*Eretmoceris eremicus*) (**Ercal®**+TX、**Eretlinee®**) +  
TX、浆角蚜小蜂 (*Eretmoceris eremicus*) (**Bemimix®**) +TX、海氏浆角蚜小蜂+TX、蒙氏  
浆角蚜小蜂 (**Bemipar®**+TX、**Eretline m®**) +TX、*Eretmoceris siphonini* +TX、四斑光缘  
瓢虫 (*Exochomus quadripustulatus*) +TX、食螨瘿蚊 (*Feltiella acarisuga*)  
(**Spidend®**) +TX、食螨瘿蚊 (**Feltiline®**) +TX、阿里山潜蝇茧蜂+TX、*Fopius*  
*ceratitivorus* +TX、芒柄花黄素 (*Wirless Beehome®*) +TX、细腰凶蓟马 (**Vespop®**) +  
TX、西方静走螨 (*Galendromus occidentalis*) +TX、莱氏棱角肿腿蜂 (*Goniozus legneri*) +  
TX、麦蛾柔茧蜂+TX、异色瓢虫 (**HarmoBeetle®**) +TX、异小杆线虫属 (*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+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 (**Natufly®**) +TX、茶足柄瘤蚜茧蜂+  
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 (**Milacewing®**) +TX、黄色花翅跳小蜂  
(*Microterys flavus*) +TX、*Muscidifurax raptorellus* 和 *Spalangia cameroni*  
(**Biopar®**) +TX、*Neodryinus typhlocybae* +TX、加州新小绥螨+TX、胡瓜钝绥螨  
(**THRYPEX®**) +TX、虚伪新小绥螨 (*Neoseiulus fallacis*) +TX、*Nesideocoris*  
*tenuis* (**NesidioBug®**+TX、**Nesibug®**) +TX、古铜黑蝇 (**Biofly®**) +TX、狡小花蝽

(*Orius insidiosus*) (**Thripior-I®**+TX、*Orioline i®*)+TX、无毛小花蝽 (*Orius laevigatus*) (**Thripior-L®**+TX、*Orioline l®*)+TX、大型小花蝽 (*Orius majusculus*) (*Orioline m®*)+TX、小黑花椿象 (**Thripior-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 (**Spidex®**+TX、*Phytoline p®*)+TX、斑腹刺益蝽 (**Podisus®**)+TX、*Pseudacteon curvatus*+TX、*Pseudacteon obtusus*+TX、*Pseudacteon tricuspidis*+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*) (络合物)+TX、胯姬小蜂属+TX、*Rhyzobius lophanthae*+TX、澳洲瓢虫+TX、*Rumina decollate*+TX、*Semielacher petiolatus*+TX、麦长管蚜 (**Ervibank®**)+TX、小卷蛾斯氏线虫 (*Nematac C®*+TX、**Millenium®**+TX、*BioNem C®*+TX、**NemAttack®**+TX、**Nemastar®**+TX、**Capsanem®**)+TX、夜蛾斯氏线虫 (**NemaShield®**+TX、*Nemasys F®*+TX、*BioNem F®*+TX、**Steinernema-System®**+TX、**NemAttack®**+TX、**Nemaplus®**+TX、*Exhibitline sf®*+TX、**Scia-rid®**+TX、**Entonem®**)+TX、锯蜂线虫 (*Steinernema kraussei*) (*Nemasys L®*+TX、*BioNem L®*+TX、*Exhibitline srb®*)+TX、里奥布拉夫线虫 (*Steinernema riobrave*) (**BioVector®**+TX、**BioVektor®**)+TX、蝼蛄斯氏线虫 (*Steinernema scapterisci*) (*Nematac S®*)+TX、斯氏线虫属+TX、*Steinernematid*属 (**Guardian Nematodes®**)+TX、深点食螨瓢虫 (**Stethorus®**)+TX、亮腹釉小蜂+TX、*Tetrastichus setifer*+TX、*Thripobius semiluteus*+TX、中华长尾小蜂 (*Torymus sinensis*)+TX、甘蓝夜蛾赤眼蜂 (*Tricholine b®*)+TX、甘蓝夜蛾赤眼蜂 (**Tricho-Strip®**)+TX、广赤眼蜂+TX、微小赤眼蜂+TX、玉米螟赤眼蜂+TX、宽脉赤眼蜂 (*Trichogramma platneri*)+TX、短管赤眼蜂+TX、螟黑点瘤姬蜂；以及

[0656] 其他生物剂，包括：脱落酸+TX、**bioSea®**+TX、银叶菌 (*Chondrostereum purpureum*) (**Chontrol Paste®**)+TX、盘长孢状刺盘孢 (**Collego®**)+TX、辛酸铜盐 (**Cueva®**)+TX、 $\delta$ 陷阱 (Delta trap) (**Traplined®**)+TX、解淀粉欧文氏菌 (*Harpin*) (**ProAct®**+TX、Ni-HIBIT Gold**CST®**)+TX、磷酸高铁 (**Ferramol®**)+TX、漏斗陷阱 (*Trapline y®*)+TX、**Gallex®**+TX、Grower's**Secret®**+TX、高油菜素内酯+TX、磷酸铁 (*Lilly Miller W0 rry Free Ferramol Slug&Snail Bait®*)+TX、MCP冰雹陷阱 (*Trapline f®*)+TX、*Microctonus hyperodae*+TX、*Mycoleptodiscus terrestris* (**Des-X®**)+TX、**BioGain®**+TX、**Aminomite®**+TX、**Zenox®**+TX、信息素陷阱 (*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(Semaspoore Organic Grasshopper **Control®**)+TX、粘着陷阱(Trapline **YF®** +TX、Rebell **Amarillo®**)+TX以及陷阱(Takitrapline y+**b®**)+TX。

[0657] 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。以上描述的混合配对物是已知的。当活性成分包括在“The Pesticide Manual[杀有害生物剂手册]”[The Pesticide Manual-A World Compendium[杀有害生物剂手册-全球概览];第13版;编者:C.D.S.TomLin;英国农作物保护委员会(The British Crop Protection Council)]中时,它们在上文对于特定化合物在圆括号内给定的条目编号之下描述于该手册中;例如,化合物“阿维菌素”在条目编号(1)之下描述。其中“[CCN]”是对于上文的特定化合物来加上的,所述的化合物包括在“Compendium of Pesticide Common Names”(农药通用名概要)中,它们可以在国际互联网[A.Wood;Compendium of Pesticide Common Names, **Copyright** ©1995-2004]中查到;例如,化合物“乙酰虫腈”描述于国际互联网地址 <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>。

[0658] 上述的活性成分中大部分在上文是通过所谓的“通用名”、相关的“ISO通用名”或在个别情况下使用的另一个“通用名”来提及。若其名称不是“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;在该情况下,使用IUPAC名称、IUPAC/化学文摘名、“化学名称”、“传统名称”、“化合物名”或“研究代码”,或若既不使用指定名称也不使用“通用名”,则使用别名。“CAS登记号”意指化学文摘登记号。

[0659] 选自1至162、B-1至B-270、C-1至C-270、A、B以及F的具有式(I)的化合物与上述活性成分的活性成分混合物包括选自表1至162、B-1至B-270、C-1至C-270、A、B以及F的化合物和上述活性成分,优选地是处于从100:1至1:6000的混合比率,尤其是从50:1至1:50,更尤其是处于从20:1至1:20的比率,甚至更尤其从10:1至1:10,非常尤其是从5:1和1:5,尤其优选的是从2:1至1:2的比率给出的,并且从4:1至2:1的比率同样是优选的,特别是处于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。

[0660] 如上描述的混合物可以被用于控制有害生物的方法中,该方法包括将含如上描述的混合物的组合物施用于有害生物或其环境中,除了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之外。

[0661] 包含选自表1至162、B-1至B-270、C-1至C-270、A、B以及F的具有式(I)的化合物以及一种或多种如上所述的活性成分的混合物可以例如以一种单一的“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)(例如一种“桶混制剂”)施用,并且当以一种顺序的方式(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独活性成分来施用。施用选自表1至162、B-1至B-270、C-1至C-270、A、B以及F的具有式(I)的化合物和如上所述的活性成分的顺序对于实施本发明而言并不是至关重要的。

[0662] 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(例如硅酮油),防腐剂,粘度调节剂,粘合剂和/或增粘剂,肥料或其他用于获得特定效果的活性成分,例如杀细菌剂、杀真菌剂、杀线虫剂、植物活化剂、杀软体动物剂或除草剂。

[0663] 根据本发明的组合物是以本身已知的方式,在不存在助剂的情况下,例如通过研磨、筛选和/或压缩固体活性成分;和在至少一种助剂的存在下,例如通过紧密混合活性成分与一种或多种助剂和/或将活性成分与一种或多种助剂一起研磨来制备。用于制备组合物的这些方法和用于制备这些组合物的具有式(I)的化合物的用途也是本发明的主题。

[0664] 这些组合物的施用方法,即是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-并且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0.1ppm与1000ppm之间,优选地在0.1ppm与500ppm之间的活性成分。每公顷的施用量总体上是每公顷1g到2000g活性成分,尤其是10g/ha到1000g/ha,优选地10g/ha到600g/ha。

[0665] 在作物保护领域中,优选的施用方法是施用至这些植物的叶(叶施药),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,这是通过用一种液体组合物将这些植物的所在地浸透或者通过将固体形式的活性成分引入植物的所在地(例如引入土壤,例如以颗粒(土施)的形式)来实现的。在水稻作物的情况下,这样的颗粒剂可以被计量地添加淹水的稻田中。

[0666] 本发明的这些化合物及其组合物还适合于植物繁殖材料的保护(例如种子,像果实、块茎或籽粒,或者苗圃植物)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,该化合物可以施用至种子籽粒(包衣),这是通过将籽粒浸渍入液体组合物中或通过施涂一种固体组合物层实现的。当该繁殖材料被种植在施用处时,还可能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因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,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,例如在每100kg种子10克至100克之间。

[0667] 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、切割枝条以及类似物并且在一个优选的实施例中是指真正的种子。

[0668] 本发明还包括经具有式(I)的化合物包衣或处理或含有具有式I的化合物的种子。尽管取决于施用的方法成分的更多或更少的部分可以渗透到该种子材料中,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,该活性成分在该种子的表面。当所述种子产物(再)种植时,它可以吸收该活性成分。在一个实施例中,本发明使得一种其上粘附有具有式(I)的化合物的植物繁殖材料可得。此外,由此可得一种包括用具有式(I)的化合物处理过的植物繁殖材料的组合物。

[0669] 种子处理包括本领域中已知的所有适合的种子处理技术,例如拌种、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实现具有式I的化合物的种子处理施用,例如,在这些种子播种之前或播种/种植过程中喷雾或通过撒粉。

[0670] 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佐剂(如载体、溶剂以及表面活性物质)被配制成组合物。这些配制品可以

处于不同的实体形式,例如,处于以下形式:撒粉剂、凝胶、可湿性粉剂、水可分散性颗粒剂、水可分散性片剂、泡腾压缩片剂、可乳化的浓缩物、微可乳化浓缩物、水包油乳剂、可流动油、水性分散体、油性分散体、悬乳剂、胶囊悬浮液、可乳化的颗粒剂、可溶性液体、水可溶性浓缩物(以水或水混溶性有机溶剂作为载体)、浸渍的聚合物膜或处于已知的其他形式,例如从关于杀有害生物剂的FAO和WHO标准的发展和使用的手册(Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides),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。可以利用例如水、液体肥料、微量营养素、生物有机体、油或溶剂来稀释。

[0671] 可以通过例如将活性成分与配制品佐剂混合来制备这些配制品以便获得处于精细分散固体、颗粒、溶液、分散体或乳剂形式的组合物。这些活性成分还可以与其他佐剂(例如精细分散固体、矿物油、植物或动物的油、改性的植物或动物的油、有机溶剂、水、表面活性物质或它们的组合)来一起配制。

[0672] 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这些活性成分。这使这些活性成分能以受控的量(例如,缓慢释放)释放到环境中。微胶囊的直径范围通常为0.1微米至500微米。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合适溶液的形式。包裹的膜可以包括例如天然的或合成的橡胶、纤维素、苯乙烯/丁二烯共聚物、聚丙烯腈、聚丙烯酸酯、聚酯、聚酰胺、聚脲、聚氨酯或化学改性的聚合物以及淀粉黄原酸盐、或本领域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。

[0673] 适合于制备根据本发明所述的这些组合物的配制佐剂本身是已知的。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、乙酸烷基酯的乙酸、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、二甘醇乙醚、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、辛胺乙酸酯、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。

[0674] 适合的固体载体是,例如滑石、二氧化钛、叶蜡石粘土、硅石、凹凸棒石粘土、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、胡桃壳粉、木素和类似的物质。



[0675] 许多表面活性物质可以有利地用于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;磺基丁二酸二烷基酯的盐,如二(2-乙基己基)磺基丁二酸钠;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-和二-烷酯的盐;以及还有其他物质,例如描述于:McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual[麦卡琴清洁剂和乳化剂年鉴],MC Publishing Corp.[MC出版公司],Ridgewood New Jersey[里奇伍德新泽西州](1981)。

[0676] 可以用于杀有害生物配制品的其他佐剂包括结晶作用抑制剂、粘度改性剂、助悬剂、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的物质与缓冲液、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、以及液体与固体肥料。

[0677] 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该待施用的混合物的0.01%到10%。例如,可以在喷雾混合物已经制备以后将该油添加剂以所希望的浓度加入喷雾罐中。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以下文献:Compendium of Herbicide Adjuvants,10<sup>th</sup> Edition,Southern Illinois University,2010[除草剂佐剂纲要,第10版,南伊利诺伊大学,2010]。

[0678] 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%的配制佐剂,该配制佐剂优选地包括按重量计从0至25%的表面活性物质。而商用产品可以优选地被配制为浓缩物,最终使用者将通常使用稀释配制品。

[0679] 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、以及受施用方法支配的其他因素、施用时间以及目标作物。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。

[0680] 优选的配制品可以具有以下成分(重量%):

[0681] 可乳化的浓缩物:

[0682] 活性成分:1%至95%,优选地60%至90%

[0683] 表面活性剂:1%至30%,优选5%至20%

[0684] 液体载体:1%至80%,优选地1%至35%

[0685] 尘剂:

[0686] 活性成分:0.1%至10%,优选地0.1%至5%

[0687] 固体载体:99.9%至90%,优选地99.9%至99%

[0688] 悬浮液浓缩剂:

[0689] 活性成分:5%至75%,优选地10%至50%

[0690] 水:94%至24%,优选地88%至30%

[0691] 表面活性剂:1%至40%,优选地2%至30%

[0692] 可湿性粉剂:

[0693] 活性成分:0.5%至90%,优选地1%至80%

[0694] 表面活性剂:0.5%至20%,优选地1%至15%

[0695] 固体载体:5%至95%,优选地15%至90%

[0696] 颗粒剂:

[0697] 活性成分:0.1%至30%,优选地0.1%至15%

[0698] 固体载体:99.5%至70%,优选地97%至85%

[0699] 以下实例进一步阐述了(但不限制)本发明。

[0700]	<u>可湿性粉剂</u>	a)	b)	c)
	活性成分	25%	50%	75%
	木质素磺酸钠	5%	5%	—
	月桂基硫酸钠	3%	—	5%
	二异丁基萘磺酸钠	—	6%	10%
	苯酚聚乙二醇醚(7-8mol的环氧乙烷)	—	2%	—
	高度分散的硅酸	5%	10%	10%
	高岭土	62%	27%	—

[0701] 将该组合与这些佐剂充分混合并且将混合物在适当的研磨机中充分研磨,从而给出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。

[0702]	<u>干种子处理用的粉剂</u>	a)	b)	c)
	活性成分	25%	50%	75%
	轻质矿物油	5%	5%	5%
	高度分散的硅酸	5%	5%	—
	高岭土	65%	40%	—
	滑石	—		20%

[0703] 将该组合与佐剂充分混合并且将该混合物在适合的研磨机中充分研磨,从而给出可以直接用于种子处理的粉剂。

[0704]	<u>可乳化浓缩剂</u>	
	活性成分	10%
	辛基苯酚聚乙二醇醚(4-5mol的环氧乙烷)	3%
	十二烷基苯磺酸钙	3%
	蓖麻油聚乙二醇醚(35mol环氧乙烷)	4%
	环己酮	30%
	二甲苯混合物	50%

[0705] 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这种浓缩物获得。

[0706]	<u>尘剂</u>	a)	b)	c)
	活性成分	5%	6%	4%
	滑石	95%	—	—
	高岭土	—	94%	—
	矿物填充剂	—	—	96%

[0707] 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获得立即可用的尘剂。此类粉剂还可以用于种子的干拌种。

[0708]	<u>挤出机颗粒剂</u>	
	活性成分	15%
	木质素磺酸钠	2%
	羧甲基纤维素	1%
	高岭土	82%

[0709] 将该组合与这些佐剂混合并且研磨,并且将混合物用水湿润。将混合物挤出并且在空气流中干燥。

[0710]	<u>包衣的颗粒剂</u>	
	活性成分	8%
	聚乙二醇 (mol.wt.200)	3%
	高岭土	89%

[0711] 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颗粒剂。

[0712] 悬浮液浓缩剂

[0713]	活性成分	40%
	丙二醇	10%
	壬基酚聚乙二醇醚 (15mol的氧化乙烷)	6%
	木质素磺酸钠	10%
	羧甲基纤维素	1%
	硅酮油 (处于在水中75%的乳液的形式)	1%
	水	32%

[0714] 将精细研磨的组合与佐剂密切混合,从而给出悬浮液浓缩剂,可以通过使用水稀释从该浓缩剂获得任何所希望稀释度的悬浮液。使用这样的稀释物,可以对活的植物连同植物繁殖材料进行处理并且对其针对微生物侵染通过喷洒、倾倒或浸渍进行保护。

[0715] 种子处理用的可流动性浓缩物

[0716]	活性成分	40%
	丙二醇	5%
	共聚物丁醇P0/E0	2%
	三苯乙烯酚,具有10-20摩尔EO	2%

1,2-苯并异噻唑啉-3-酮(处于在水中20%的溶液形式)	0.5%
单偶氮-颜料钙盐	5%
硅酮油(处于在水中75%的乳液的形式)	0.2%
水	45.3%

[0717] 将精细研磨的组合与佐剂密切混合,从而给出悬浮液浓缩剂,可以通过使用水稀释从该浓缩剂获得任何所希望稀释度的悬浮液。使用这样的稀释物,可以对活的植物连同植物繁殖材料进行处理并且对其针对微生物侵染通过喷洒、倾倒或浸渍进行保护。

#### [0718] 缓释的胶囊悬浮剂

[0719] 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颗粒尺寸。向此乳液中添加2.8份的1,6-己二胺于5.3份的水中的混合物。将该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。

[0720] 配制品类型包括乳液浓缩剂(EC)、悬浮液浓缩物(SC)、悬乳剂(SE)、胶囊悬浮剂(CS)、水可分散性颗粒剂(WG)、可乳化性颗粒剂(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)、可溶性浓缩剂(SL)、超低容量悬浮剂(SU)、超低容量液剂(UL)、母药(TK)、可分散性浓缩剂(DC)、可湿性粉剂(WP)、可溶性颗粒剂(SG)或与农业上可接受的佐剂组合的任何技术上可行的配制品。

[0721] 以下这些实例展示但不限制本发明。

[0722] 本发明的该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疗效,这可以由本领域的普通技术人员使用在实例中概述的实验程序,使用更低的施用率(如果必要的话)例如,50ppm、12.5ppm、6ppm、3ppm、1.5ppm、0.8ppm、0.4ppm、0.2ppm、0.1ppm或甚至更低的浓度来证实。

#### [0723] 制备实例:

[0724] “Mp”是指以℃计的熔点。自由基表示甲基基团。<sup>1</sup>H和<sup>19</sup>F NMR测量值在Brucker 400MHz或300MHz分光计上记录,化学位移相对于TMS标准品以ppm给出。光谱在如指定的氘代溶剂中测量。

[0725] 以下的LC-MS方法用来表征这些化合物:方法J

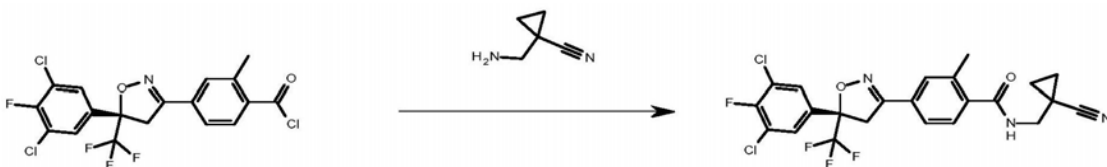
使用 Sample Organizer (具有样品管理器 FTN (Sample Manager), H 级 QSM, 柱管理器 (Column Manager), 2 x 柱管理器 Aux (Manager Aux), 光电二极管阵列, ELSD 和 SQD 2) 在沃特斯 (Waters) Aquity UPLC-MS (配备有沃特斯 HSS T3 C18 柱 (柱长 30 mm, 柱内径 2.1 mm, 粒径 1.8 微米))。该分析是根据以下梯度表利用一种二分钟运行时间来进行:

[0726]

时间 (分钟)	溶剂 A (%)	溶剂 B (%)	流速 (ml/min)
0	95	5	0.7
1.75	0	100	0.7
1.76	0	100	0.7
2	0	5	0.7
2.01	95	5	0.7
2.11	95	5	0.7
溶剂 A: H <sub>2</sub> O, 具有 0.05% 三氟乙酸 (TFA)			
溶剂 B: CH <sub>3</sub> CN, 具有 0.05% 三氟乙酸 (TFA)			

[0727] 实例1: N-[(1-氰基环丙基)甲基]-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酰胺 (实例A01, 在表A中)

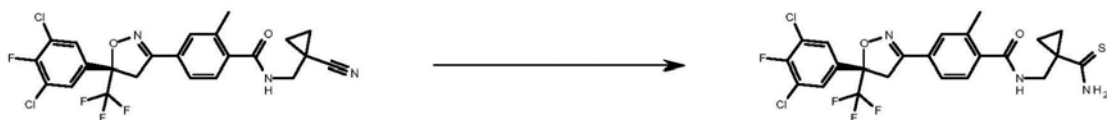
[0728]



[0729] 将1-(氨基甲基)环丙烷甲腈 (0.53g) 于二氯甲烷 (36ml) 中的盐酸盐悬浮液用三乙胺 (0.74g) 处理, 并在20℃搅拌。向此溶液中缓慢添加溶液4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酰氯 (11mL, 0.33M, 在甲苯中) (4-[5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酸的制备描述在W02013/026695中)。将此混合物搅拌24小时, 然后将其用乙酸乙酯和HCl (0.5M) 的溶液稀释。分离各相并且将水层用乙酸乙酯萃取。将有机相合并, 经硫酸钠干燥, 过滤并蒸发以产生粗产物, 将该粗产物通过硅胶柱层析用乙酸乙酯-环己烷混合物作为洗脱液 (梯度从0:1至1:0) 进一步纯化以给出呈轻微白色泡沫的标题化合物 (1.79g)。<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz, δ 以ppm): 1.12-1.24 (m, 2H) 1.31-1.40 (m, 2H) 2.50 (s, 3H) 3.56 (d, 2H) 3.71 (d, 1H) 4.10 (d, 1H) 6.28 (t, 1H) 7.42-7.51 (m, 1H) 7.47-7.57 (m, 2H) 7.60 (d, 2H)。

[0730] 实例2: N-[(1-硫代氨基甲酰基环丙基)甲基]-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酰胺 (实例B01, 在表A中)

[0731]



[0732] 向N-[(1-氰基环丙基)甲基]-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酰胺 (0.20g) 溶解于甲醇 (2.3mL) 中的溶液中添加21%水性硫化铵 (1.0mL) 的溶液, 并将该溶液回流24小时。然后添加一些另外的21%水性硫化铵 (0.50g, 0.51mL, 1.6mmol) 并将该溶液回流5小时。允许该溶液冷却至室温并用乙酸乙酯和

水稀释。分离各相并且将水层用乙酸乙酯萃取。将有机相合并,经硫酸镁干燥,过滤并蒸发以产生粗产物,将该粗产物通过硅胶柱层析用乙酸乙酯-环己烷混合物作为洗脱液(梯度从0:1至1:0)进一步纯化以给出含有标题化合物的混合物。其可以在制备型UPLC并通过第二硅胶柱层析进一步纯化以给出呈轻微白色固体的该标题化合物(86mg)。<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz,  $\delta$ 以ppm):

[0733] 1.05-1.19 (m, 2H) 1.66-1.78 (m, 2H) 2.46 (s, 3H) 3.70 (d, 1H) 3.78 (d, 2H) 4.01-4.16 (m, 1H) 6.51 (t, 1H) 7.43 (d, 1H) 7.50-7.66 (m, 4H) 8.53 (br. s., 1H)。

[0734] 实例3: N-[ (1-氨基甲酰基环丙基) 甲基]-4-[ (5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酰胺(实例C01, 在表A中)



[0736] 在环境温度下,向N-[ (1-氰基环丙基) 甲基]-4-[ (5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酰胺(1g) 溶解于二甲亚砜(10mL) 中的溶液中添加碳酸钾(0.19g)。然后将该反应混合物冷却至0℃-5℃,并逐滴添加30%过氧化氢(1.4mL) 的溶液。然后,在室温下,将该反应混合物搅拌18小时。将该溶液用乙酸乙酯和氯化氢的水性溶液(0.5M) 稀释。分离各相并且将水层用乙酸乙酯萃取。将有机相合并,经硫酸镁干燥并过滤。过氧化物试验显示在有机相中存在残余的过氧化物,因此将它们用亚硫酸氢钠溶液(约40%水溶液) 处理。将该混合物再次在乙酸乙酯与水之间萃取。将有机相合并,经硫酸镁干燥,过滤并蒸发以产生粗产物,将该粗产物通过硅胶柱层析用乙酸乙酯-环己烷混合物作为洗脱液(梯度从0:1至1:0) 进一步纯化以给出呈轻微白色泡沫的标题化合物(888mg)。<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz,  $\delta$ 以ppm): 0.84-0.94 (m, 2H) 1.27-1.35 (m, 2H) 2.47 (s, 3H) 3.60-3.76 (m, 3H) 4.03-4.13 (m, 1H) 6.44 (t, 1H) 7.36-7.46 (m, 1H) 7.48-7.55 (m, 2H) 7.59 (d, 2H)

[0737] 实例4: 乙基N-[ (1-氰基环丙基) 甲基]-N-[4-[ (5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酰基]氨基甲酸酯(实例F01, 在表F中)



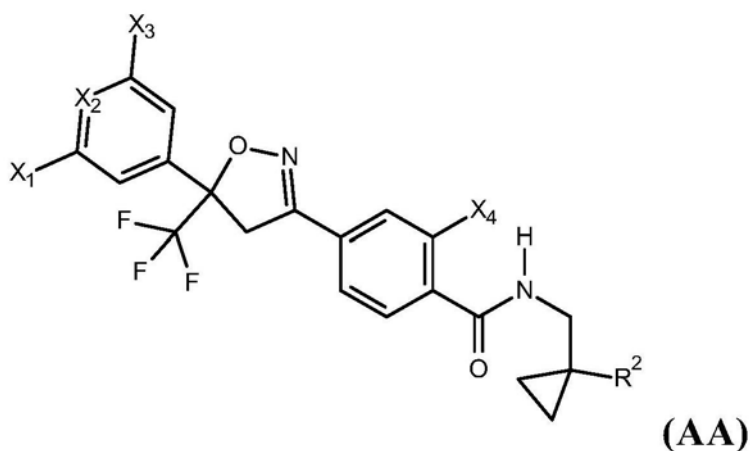
[0739] 在氩气下,向N-[ (1-氰基环丙基) 甲基]-4-[ (5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酰胺(0.50g) 溶解于N,N-二甲基甲酰胺(9.7mL) 的溶液中分部分添加氰化钠(60%悬浮于石蜡油中,0.043g),并将该反应在室温搅拌一小时。然后添加氯甲酸乙酯(0.12mL) 并将该反应在室温搅拌23h。将该溶液用乙酸乙酯和水稀释。将各相分离,并将有机相进一步用氯化铵饱和溶液萃取。将有机相合并,经硫酸镁干燥,过滤并蒸发以产生粗产物,将该粗产物通过硅胶柱层析用乙酸乙酯-环己烷混合物作为洗脱液(梯度从0:1至1:0) 进一步纯化以给出呈轻微白色泡沫的标题化合物(249mg)。<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz,  $\delta$ in ppm): 7.60 (d, 2H) 7.55 (s, 1H) 7.50-7.53 (m, 1H) 7.30 (d, 1H) 4.12

(q, 2H) 4.03–4.09 (m, 3H) 3.69 (d, 1H) 2.40 (s, 3H) 1.32–1.39 (m, 2H) 1.21–1.31 (m, 2H) 1.10 (t, 3H)。

[0740] 以相似方式制备其他化合物。

[0741] 表A:式AA的化合物

[0742]



[0743]

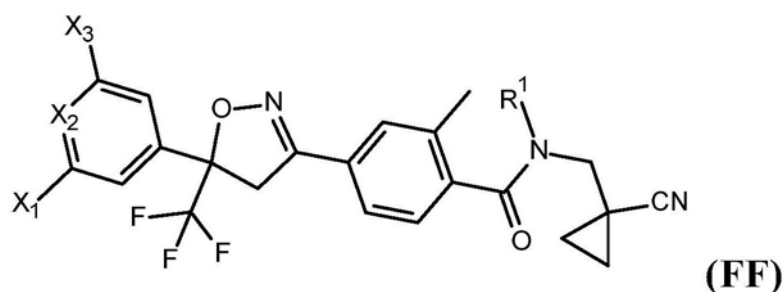
化合物编号	X <sub>1</sub>	X <sub>2</sub>	X <sub>3</sub>	X <sub>4</sub>	R <sup>2</sup>	异噁唑啉环上的立体化学
A01	Cl	C-F	Cl	CH <sub>3</sub>	CN	富含S同分异构体
A02	Cl	C-H	Cl	CH <sub>3</sub>	CN	富含S同分异构体
A03	Cl	C-Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	CN	富含S同分异构体
A04	Cl	C-H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CN	富含S同分异构体
A05	Cl	C-OMe	Cl	CH <sub>3</sub>	CN	富含S同分异构体
A06	Cl	C-F	Cl	CH <sub>3</sub>	CN	外消旋混合物
A07	CF <sub>3</sub>	C-Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CN	外消旋混合物
A08	F	C-Cl	H	CH <sub>3</sub>	CN	外消旋混合物
A09	Cl	C-Br	Cl	CH <sub>3</sub>	CN	外消旋混合物
A10	H	C-Br	H	CH <sub>3</sub>	CN	外消旋混合物
A11	H	C-OCF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CN	外消旋混合物
A12	Cl	C-H	Cl	cPr	CN	外消旋混合物
A13	Cl	C-H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CN	外消旋混合物
A14	Cl	C-Cl	H	CH <sub>3</sub>	CN	外消旋混合物
A15	Cl	C-H	Cl	Cl	CN	外消旋混合物
A16	CF <sub>3</sub>	C-H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CN	外消旋混合物
A17	Cl	C-H	Cl	Br	CN	外消旋混合物
A18	CF <sub>3</sub>	C-H	Br	CH <sub>3</sub>	CN	富含S同分异构体
A19	CF <sub>3</sub>	C-H	Cl	Cl	CN	富含S同分异构体
A20	CF <sub>3</sub>	C-H	H	CH <sub>3</sub>	CN	富含S同分异构体
A21	Cl	C-Cl	Cl	Cl	CN	富含S同分异构体
A22	Cl	C-F	Cl	Cl	CN	富含S同分异构体
A23	Cl	C-Cl	Cl	Br	CN	富含S同分异构体
A24	Cl	C-F	Cl	Br	CN	富含S同分异构体
B01	Cl	C-F	Cl	CH <sub>3</sub>	C(S)NH <sub>2</sub>	富含S同分异构体

B02	C1	C-H	C1	CH <sub>3</sub>	C (S) NH <sub>2</sub>	富含S同分异构体
C01	C1	C-F	C1	CH <sub>3</sub>	C (O) NH <sub>2</sub>	富含S同分异构体
C02	C1	C-H	C1	CH <sub>3</sub>	C (O) NH <sub>2</sub>	富含S同分异构体

[0744] 表B:

化合物编号	IUPAC 名称	异噁唑啉环上的立体化学
D01	N-[(1-氟基环丙基)甲基]-5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]吡啶-2-甲酰胺	外消旋混合物
D02	N-[(1-氟基环丙基)甲基]-6-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-4-甲基-吡啶-3-甲酰胺	外消旋混合物
E01	N-[1-(1-氟基环丙基)乙基]-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酰胺	富含 S 同分异构体

[0746] 表F:式FF的化合物



化合物编号	X <sub>1</sub>	X <sub>2</sub>	X <sub>3</sub>	R <sup>1</sup>	异噁唑啉环上的立体化学
F01	Cl	C-F	Cl	C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	富含 S 同分异构体
F02	Cl	C-F	Cl	C(O)(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	富含 S 同分异构体
F03	Cl	C-F	Cl	C(O)cPr	富含 S 同分异构体
F04	Cl	C-F	Cl	C(O)OCH <sub>3</sub>	富含 S 同分异构体
F05	Cl	C-F	Cl	SC(O)OCH <sub>3</sub>	富含 S 同分异构体
F06	Cl	C-F	Cl	CH <sub>2</sub> OC(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	富含 S 同分异构体
F07	Cl	C-F	Cl	CH <sub>2</sub> OC(O)CH <sub>3</sub>	富含 S 同分异构体
F08	Cl	C-F	Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	富含 S 同分异构体
F09	Cl	C-F	Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	富含 S 同分异构体
F10	Cl	C-F	Cl	CH <sub>2</sub> OC(O)(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	富含 S 同分异构体
F11	Cl	C-F	Cl	C(O)OCH <sub>2</sub> Cl	富含 S 同分异构体
F12	Cl	C-F	Cl	CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )C(O)OCH <sub>3</sub>	富含 S 同分异构体

[0749] 表A1 (表A的化合物的分析数据):

化合物编号	LC-MS 方法	RT (min)	[M+H] <sup>+</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ ppm
A01				1.12 - 1.24 (m, 2 H) 1.31 - 1.40 (m, 2 H) 2.50 (s, 3 H) 3.56 (d, 2 H) 3.71 (d, 1 H) 4.10 (d, 1 H) 6.28



[0751]

				(t, 1 H) 7.42 - 7.51 (m, 1 H) 7.47 - 7.57 (m, 2 H) 7.60 (d, 2 H)
A02				1.13 - 1.24 (m, 2 H) 1.31 - 1.40 (m, 2 H) 2.50 (s, 3 H) 3.56 (d, 2 H) 3.72 (d, 1 H) 4.03 - 4.15 (m, 1 H) 6.28 (t, 1 H) 7.40 - 7.51 (m, 2 H) 7.51 - 7.60 (m, 4 H)
A03				1.13 - 1.23 (m, 2 H) 1.31 - 1.40 (m, 2 H) 2.51 (s, 3 H) 3.56 (d, 2 H) 3.71 (d, 1 H) 4.05 - 4.12 (m, 1 H) 6.24 (br. s., 1 H) 7.43 - 7.51 (m, 1 H) 7.50 - 7.58 (m, 2 H) 7.66 (s, 2 H)
A04				1.15 - 1.24 (m, 2 H) 1.31 - 1.41 (m, 2 H) 2.51 (s, 3 H) 3.56 (d, 2 H) 3.74 (d, 1 H) 4.11 - 4.22 (m, 1 H) 6.26 (s, 1 H) 7.43 - 7.52 (m, 1 H) 7.52 - 7.60 (m, 2 H) 7.70 (s, 1 H) 7.77 (s, 1 H) 7.84 (s, 1 H)
A05				1.09 - 1.22 (m, 2 H) 1.30 - 1.39 (m, 2 H) 2.50 (s, 3 H) 3.51 - 3.61 (m, 2 H) 3.65 - 3.77 (m, 1 H) 3.94 (s, 3 H) 4.02 - 4.13 (m, 1 H) 6.20 - 6.32 (m, 1 H) 7.42 - 7.51 (m, 1 H) 7.51 - 7.65 (m, 4 H)
A06				1.16 - 1.24 (m, 2 H) 1.32 - 1.39 (m, 2 H) 2.50 (s, 3 H) 3.56 (d, 2 H) 3.70 (d, 1 H) 4.03 - 4.20 (m, 1 H) 6.26 (m, 1 H) 7.44 - 7.67 (m, 5 H)
A07	J	1.65	598.4	
A08	J	1.48	480.4	
A09	J	1.65	574.3	
A10	J	1.47	506.3	
A11	J	1.49	512.4	
A12	J	1.61	522.4	
A13	J	1.51	476.4	
A14	J	1.54	496.3	
A15	J	1.58	516.3	
A16	J	1.57	564.4	
A17	J	1.59	560.3	
A18	J	1.58	574.3	
A19	J	1.58	550.3	
A20	J	1.46	496.4	
A21	J	1.66	550.3	
A22	J	1.59	534.3	
A23	J	1.67	594.2	
A24	J	1.6	578.3	
B01				1.05 - 1.19 (m, 2 H) 1.66 - 1.78 (m, 2 H) 2.46 (s, 3 H) 3.70 (d, H) 3.78 (d, 2 H) 4.01 - 4.16 (m, 1 H) 6.51 (t, 1 H) 7.43 (d, 1 H) 7.50 - 7.66 (m, 4 H) 8.53 (br. s., 1 H)。
B02				1.06 - 1.17 (m, 2 H) 1.68 - 1.77 (m, 2 H) 2.46 (s, 3 H) 3.71 (d, 1 H) 3.77 (d, 2 H) 4.03 - 4.13 (m, 1 H) 6.53 (t, 1 H) 7.37 - 7.47 (m, 2 H) 7.48 - 7.57 (m, 4 H) 7.57 - 7.67 (m, 1 H) 8.57 (br. s., 1 H)
C01				0.84 - 0.94 (m, 2 H) 1.27 - 1.35 (m, 2 H) 2.47 (s, 3 H) 3.60 - 3.76 (m, 3 H) 4.03 - 4.13 (m, 1 H)

[0752]

				6.44 (t, 1 H) 7.36 - 7.46 (m, 1 H) 7.48 - 7.55 (m, 2 H) 7.59 (d, 2 H)
C02				0.81 - 0.96 (m, 2 H) 1.28 - 1.35 (m, 2 H) 2.47 (s, 3 H) 3.60 - 3.77 (m, 3 H) 4.03 - 4.12 (m, 1 H) 6.43 (t, 1 H) 7.37 - 7.47 (m, 2 H) 7.48 - 7.59 (m, 4 H)

[0753] 表B1 (表B的化合物的分析数据):

[0754]

化合物编号	LC-MS 方法	RT (min)	[M+H] <sup>+</sup>	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿-d) $\delta$ ppm
D01	J	1.56	483.3	
D02	J	1.53	497.4	
E01				0.96 - 1.13 (m, 1 H) 1.21 - 1.46 (m, 3 H) 1.63 (d, 3 H) 2.66 (s, 3 H) 3.72 (d, 1 H) 4.11 (d, 1 H) 4.59 (q, 1 H) 7.52 - 7.65 (m, 4 H) 8.04 (d, 1 H)

[0755] 表F1 (表F的化合物的分析数据):

[0756]

化合物编号	<sup>1</sup> H NMR
F01	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ ppm 7.60 (d, 2 H) 7.55 (s, 1 H) 7.50 - 7.53 (m, 1 H) 7.30 (d, 1 H) 4.12 (q, 2 H) 4.03 - 4.09 (m, 3 H) 3.69 (d, 1 H) 2.40 (s, 3 H) 1.32 - 1.39 (m, 2 H) 1.21 - 1.31 (m, 2 H) 1.10 (t, 3 H)
F02	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ ppm 7.71 (d, 1 H) 7.64 (s, 1 H) 7.56 - 7.62 (m, 3 H) 4.11 (d, 1 H) 3.71 (d, 1 H) 3.60 (s, 2 H) 2.44 (s, 3 H) 1.41 (s, 9 H) 1.20 - 1.27 (m, 2 H) 0.96 - 0.98 (m, 2 H)
F03	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ ppm 7.60 (m, 3 H) 7.52 - 7.57 (m, 1 H) 7.49 - 7.52 (m, 1 H) 4.10 (d, 1 H) 4.05 (s, 2 H) 3.70 (d, 1 H) 2.51 (s, 3 H) 1.38 - 1.47 (m, 1 H) 1.30 - 1.38 (m, 2 H) 1.15 - 1.24 (m, 2 H) 1.06 (br t, 2 H) 0.67 (br d, 2 H)
F04	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ ppm 7.60 (d, 2 H) 7.55 (s, 1 H) 7.50 - 7.54 (m, 1 H) 7.29 (d, 1 H) 4.10 (d, 1 H) 4.06 (s, 2 H) 3.64 - 3.73 (m, 4 H) 2.40 (s, 3 H) 1.32 - 1.40 (m, 2 H) 1.20 - 1.32 (m, 2 H)
F05	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ ppm 7.60 (d, 2 H) 7.52 (s, 1 H) 7.50 (br d, 1 H) 7.30 - 7.26 (m, 1 H) 4.05 - 4.16 (m, 1 H) 3.84 (s, 3 H) 3.65 - 3.74 (m, 1 H) 2.39 (s, 3 H) 1.39 (br s, 2 H) 1.22 (br s, 2 H)
F06	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ ppm 7.60 (d, 2 H) 7.57 (s, 1 H) 7.54 (d, 1 H) 7.34 (d, 1 H) 5.17 - 5.45 (m, 2 H) 4.06 - 4.15 (m, 1 H) 3.78 (br s, 2 H) 3.70 (d, 1 H) 2.55 (dt, 1 H) 2.41 (s, 3 H) 1.33 - 1.41 (m, 2 H) 1.20 - 1.29 (m, 2 H) 1.16 (d, 6 H)
F07	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ ppm 7.60 (d, 2 H) 7.57 (s, 1 H) 7.52 - 7.56 (m, 1 H) 7.34 (d, 1 H) 5.17 - 5.45 (m, 2 H) 4.11 (d, 1 H) 3.77 (br s, 2 H) 3.70 (d, 1 H) 2.40 (s, 3 H) 2.07 (s, 3 H) 1.35 - 1.41 (m, 2 H) 1.19 - 1.29 (m, 2 H)
F08	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ ppm 7.60 (d, 2 H) 7.56 (s, 1 H) 7.51 - 7.55 (m, 1 H) 7.35 (d, 1 H) 4.53 - 4.79 (m, 2 H) 4.11 (d, 1 H) 3.76 (br

[0757]		s, 2 H) 3.70 (d, 1 H) 3.27 (q, 2 H) 2.40 (s, 3 H) 1.36 (br s, 2 H) 1.21 - 1.32 (m, 2 H) 1.12 (t, 3 H)
	F09	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm 7.60 (d, 2 H) 7.56 (s, 1 H) 7.53 (br d, 1 H) 7.35 (d, 1 H) 4.62 (br s, 2 H) 4.11 (d, 1 H) 3.75 (br s, 2 H) 3.70 (d, 1 H) 3.14 (s, 3 H) 2.40 (s, 3 H) 1.36 (br s, 2 H) 1.17 - 1.31 (m, 2 H)
	F10	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm 7.60 (d, 2 H) 7.57 (s, 1 H) 7.54 (d, 1 H) 7.34 (d, 1 H) 5.16 - 5.46 (m, 2 H) 4.11 (d, 1 H) 3.78 (br s, 2 H) 3.70 (d, 1 H) 2.42 (s, 3 H) 1.39 (br s, 2 H) 1.21 - 1.28 (m, 2 H) 1.19 (s, 9 H)
	F11	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm 7.60 (d, 2 H) 7.57 (s, 1 H) 7.51 - 7.56 (m, 1 H) 7.35 (d, 1 H) 5.65 (s, 2 H) 4.04 - 4.16 (m, 3 H) 3.70 (d, 1 H) 2.42 (s, 3 H) 1.35 - 1.46 (m, 2 H) 1.18 - 1.33 (m, 2 H)
	F12	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm 7.33 - 7.64 (m, 5 H) 4.61 - 5.41 (m, 2 H) 4.10 (d, 1 H) 3.45 - 3.83 (m, 6 H) 2.57 - 3.29 (m, 3 H) 2.32 - 2.53 (m, 3 H) 0.76 - 1.38 (m, 4 H)

[0758] 生物学实例:

[0759] 这些实例展示了具有式(I)的化合物的杀有害生物/杀昆虫特性。

[0760] 进行了如下试验:

[0761] 实例B1:黄瓜条叶甲(玉米根虫)

[0762] 将24孔微量滴定板中的置于琼脂层上的玉米芽用通过喷雾用从10' 000ppm DMSO储备溶液中制备的水性测试溶液进行处理。在干燥之后,用L2期幼虫对各板进行侵染(6至10只/孔)。侵染4天之后,相比于未处理样品,针对死亡率和生长抑制对这些样品进行评估。

[0763] 以下化合物在200ppm施用率下给出了两个类别(死亡率或生长抑制)中至少一个的至少80%的效果:

[0764] A01、A02、A03、A04、A05、A06、A07、A08、A09、A10、A11、A12、A13、A14、A15、A16、A17、A18、A19、A20、A21、A22、A23、A24、B01、B02、C01、C02、D01、D02、F01、F02、F03、F04、F05、F06、F07、F08、F09、F10、F11、F12。

[0765] 实例B2:桃蚜(绿色桃蚜虫)。

[0766] 将来自10' 000ppm DMSO储备溶液制备的测试化合物通过移液管施用到24孔微量滴定板中并且与蔗糖溶液进行混合。将这些平板用拉伸的Parafilm膜进行封闭。将24孔塑料模板置放在平板上并且将经过侵染的豌豆幼苗直接置放在Parafilm膜上。将经过侵染的平板用凝胶印迹纸与另外的塑料模板进行封闭,并且然后倒置。侵染5天之后,针对死亡率对这些样品进行评估。

[0767] 以下化合物在12ppm测试比率下得到至少80%的死亡率:

[0768] A01、A02、A03、A04、A06、A07、A08、A09、A10、A12、A15、A16、A17、A18、A19、A20、A21、A22、A24、B01、B02、C01、C02、D02、F02、F03、F05、F06、F07、F08、F09、F10、F11。

[0769] 实例B3:小菜蛾(*Plutella xylostella*) (小菜蛾(Diamond back moth))

[0770] 将具有人工饲料的24孔微量滴定板用从10' 000ppm DMSO储备溶液中制备的水性测试溶液通过移液进行处理。在干燥之后,用L2期幼虫对各板进行侵染(10至15只/孔)。侵染5天之后,相比于未处理样品,针对死亡率和生长抑制对这些样品进行评估。

[0771] 以下化合物在200ppm施用率下给出了两个类别(死亡率或生长抑制)中至少一个的至少80%的效果:

[0772] A01、A02、A03、A04、A05、A06、A07、A08、A09、A10、A11、A12、A13、A14、A15、A16、A17、

A18、A19、A20、A21、A22、A23、A24、B01、B02、C01、C02、D01、D02、E01、F01、F02、F03、F04、F05、F06、F07、F08、F09、F10、F11、F12。

[0773] 实例B4:海灰翅夜蛾(埃及棉叶虫)

[0774] 将棉花叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并且用从10'000ppm DMSO储备溶液中制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后,将叶圆片用五只L1期幼虫进行侵染。侵染3天之后,相比于未处理样品,针对死亡率、拒食效果以及生长抑制对这些样品进行评估。当类别(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。

[0775] 以下化合物在200ppm施用率下得到至少80%的控制:

[0776] A01、A02、A03、A04、A05、A06、A07、A08、A09、A10、A11、A12、A13、A14、A15、A16、A17、A18、A19、A20、A21、A22、A23、A24、B01、B02、C01、C02、D02、E01、F01、F02、F03、F04、F05、F06、F07、F08、F09、F10、F11、F12。

[0777] 实例B5:二点叶螨(二斑叶螨):摄食/接触活性

[0778] 将24孔微量滴定板中的琼脂上的豆叶圆片用从10'000ppm DMSO储备溶液中制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后,将叶圆片用混合年龄的螨种群进行侵染。侵染8天之后,针对混合种群(流动平台)的死亡率对这些样品进行评估。

[0779] 以下化合物在200ppm施用率下得到至少80%的死亡率:

[0780] A01、A02、A03、A04、A05、A06、A07、A08、A09、A10、A12、A13、A14、A15、A16、A17、A18、A19、A20、A21、A23、A24、B01、B02、C01、C02、D02、F01、F02、F03、F04、F05、F06、F07、F08、F09。

[0781] 实例B6:烟蓟马(葱蓟马)摄食/接触活性:

[0782] 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储备溶液中制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后,将这些叶圆片用混合年龄的蓟马群侵染。侵染6天之后,针对死亡率对这些样品进行评估。

[0783] 以下化合物在200ppm施用率下得到至少80%的死亡率:

[0784] A01、A02、A03、A04、A05、A06、A07、A08、A09、A12、A13、A14、A15、A16、A17、A18、A19、A20、A21、A22、A23、A24、B01、B02、C01、C02、D01、D02、E01、F01、F02、F03、F04、F05、F06、F07、F08、F10。