(19)中华人民共和国国家知识产权局

(12)发明专利

(10)授权公告号 CN 108026089 B
(45)授权公告日 2021.10.22

(21)申请号 201680055178.3
(22)申请日 2016.09.22
(65)同一申请的已公布的文献号
申请公布号 CN 108026089 A
(43)申请公布日 2018.05.11
(30)优先权数据
15186540.9 2015.09.23 EP
(85)PCT国际申请进入国家阶段日
2018.03.22
(86)PCT国际申请的申请数据
PCT/EP2016/072588 2016.09.22
(87)PCT国际申请的公布数据
WO2017/050922 EN 2017.03.30
(73)专利权人 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 A·斯托勒 T·皮特纳 M·艾尔卡瑟米
(74)专利代理机构 中国贸促会专利商标事务所有限公司 11038
代理人 张敏
(51)Int.Cl.
C07D 413/14(2006.01)
A01N 43/80(2006.01)
(56)对比文件
CN 102639529 A,2012.08.15
CN 101768129 A,2010.07.07
US 20110144334 A1,2011.06.16
WO 2013026933 A1,2013.02.28
审查员 郭军霞

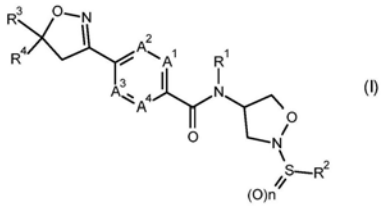
权利要求书4页 说明书109页

(54)发明名称

作为杀虫剂的异噁唑啉取代的苯甲酰胺和类似物

(57)摘要

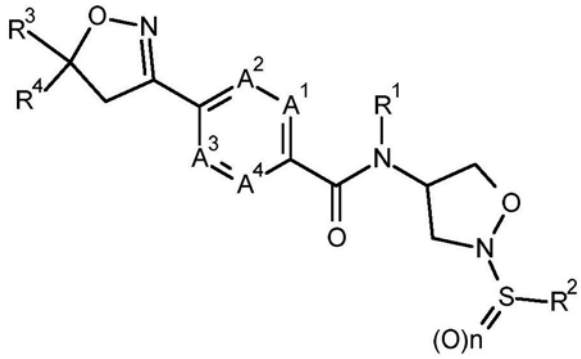
本发明涉及具有式(I)的化合物，其中A^1、A^2、A^3、A^4、R^1、R^2、R^3、R^4以及n是如在权利要求1中所定义的；或其互变异构体、异构体、对映异构体、盐或N-氧化物；涉及用于制备具有式(I)的化合物的中间体，涉及包含它们的组合物并且涉及使用它们来对抗并且控制昆虫、螨、线虫和软体动物有害生物的方法。



(I)

CN 108026089 B

1.一种具有式(I)的化合物



(I)

其中，

A^1、A^2、A^3以及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-或C_1-C_8烷氧基羰基-；

R^2是C_1-C_8烷基或被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基或被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8卤代烷基、C_3-C_8环烷基或被一个至三个R^{6b}取代的C_3-C_8环烷基、苯基、被一个至三个R^7取代的苯基、苯基-C_1-C_4烷基、其中苯基部分被一个至三个R^7取代的苯基-C_1-C_4烷基、5-6元杂芳基、被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基、卤素或-N(R^8)(R^9)；

R^3是C_1-C_8卤代烷基；

R^4是苯基、被一个至三个R^7取代的苯基、吡啶基或被一个至三个R^7取代的吡啶基；

R^5独立地是卤素或C_1-C_8烷基，或在相邻碳原子上的两个R^5一起形成-CH=CH-CH=CH-桥或-N=CH-CH=CH-桥；

R^{6a}独立地是氰基、卤素、硝基、氨基、C_1-C_8烷基氨基、N,N-C_1-C_8二烷基氨基、羟基、C_1-C_8烷氧基、或C_1-C_8卤代烷氧基；

R^{6b}独立地是卤素、氰基、硝基、氧代基、C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基、氨基、C_1-C_8烷基氨基、N,N-C_1-C_8二烷基氨基、羟基、C_1-C_8烷氧基、C_1-C_8卤代烷氧基、苯基、被一个至三个R^7取代的苯基、5-6元杂芳基、被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基；

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烷氧基或C_1-C_8卤代烷氧基；

R^8和R^9独立地是氢、氰基、C_1-C_8烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷基、C_2-C_8烯基、C_3-C_8环烷基、被一个至三个R^{6b}取代的C_3-C_8环烷基、苯基-C_1-C_4烷基或-S(O)$_2$$R^{10}$；

R^{10}是C_1-C_8烷基；

n是2；

或其盐。

2.根据权利要求1所述的化合物，其中A^1是CR^5并且A^2、A^3和A^4各自是CH，其中R^5是如在权利要求1中所定义的。

3.根据权利要求1或权利要求2所述的化合物，其中，R^2是C_1-C_8烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷基或-N(R^8)(R^9)，其中R^8、R^9以及R^{6a}是如在权利要求1中所定义的。

4.根据权利要求1或权利要求2所述的化合物，其中，R^3是C_1-C_4卤代烷基。

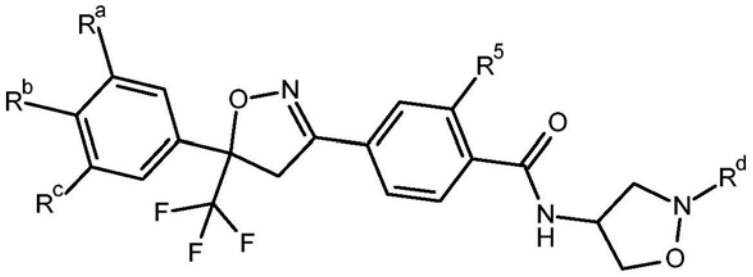
5.根据权利要求1或权利要求2所述的化合物，其中，R^4是苯基或被一个至三个R^7取代的苯基；其中R^7独立地是卤素、氰基、C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基、C_1-C_8烷氧基或C_1-C_8卤代烷氧

基。

6.根据权利要求1或权利要求2所述的化合物，其中，A^1是CR^5并且A^2、A^3和A^4各自是CH；R^1是氢、甲基、乙基、甲基羰基-、或甲氧基羰基；R^2是C_1-C_8烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_8卤代烷基、二-C_1-C_8烷基氨基、C_1-C_4烷基氨基、氟、苯基、被一个至三个R^7取代的苯基、5-6元杂芳基或被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基；R^3是C_1-C_4卤代烷基；R^4是苯基或被一个至三个R^7取代的苯基；并且n是2；其中R^5是卤素或C_1-C_8烷基；R^{6a}独立地是氰基、卤素、硝基、C_1-C_4烷氧基、或C_1-C_4卤代烷氧基；并且R^7独立地是卤素、氰基、硝基、C_1-C_4烷基、或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。

7.根据权利要求1或权利要求2所述的化合物，其中，A^1是CR^5并且A^2、A^3和A^4各自是CH；R^1是氢；R^2是C_1-C_4烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_4烷基、C_3-C_5环烷基、C_1-C_4卤代烷基、二-C_1-C_4烷基氨基、C_1-C_4烷基氨基、氟、1-3卤素取代的苯基、或5-6元杂芳基；R^3是氯二氟甲基或三氟甲基；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；并且n是2；其中R^5是溴、氯、氟、甲基或乙基；R^{6a}独立地是氟、氰基、硝基、甲氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基；并且R^{6b}独立地是溴、氯、氟、氰基、硝基、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基。

8.根据权利要求1所述的具有式(I)的化合物，由具有式(Ib)的化合物表示



(Ib)

其中，

R^a是氢、卤素、氰基、C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基、或C_1-C_8卤代烷氧基；

R^b是氢、卤素、氰基、C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基、或C_1-C_8卤代烷氧基；

R^c是氢、卤素、氰基、C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基、或C_1-C_8卤代烷氧基；

R^d是$S(O)_2$-R^2；

R^2是C_1-C_8烷基或被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基或被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8卤代烷基、C_3-C_8环烷基或被一个至三个R^{6b}取代的C_3-C_8环烷基、苯基、被一个至三个R^7取代的苯基、苯基-C_1-C_4烷基、其中苯基部分被一个至三个R^7取代的苯基-C_1-C_4烷基、5-6元杂芳基、被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基、-N(R^8)(R^9)、氟；

R^5独立地是卤素、或C_1-C_8烷基；

R^{6a}独立地是C_1-C_8烷氧基、或C_1-C_8卤代烷氧基；

R^{6b}独立地是氧代基、氨基、C_1-C_8烷基氨基、N,N-C_1-C_8二烷基氨基、C_1-C_8烷氧基、C_1-C_8卤代烷氧基、苯基、被一个至三个R^7取代的苯基、5-6元杂芳基或被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基；

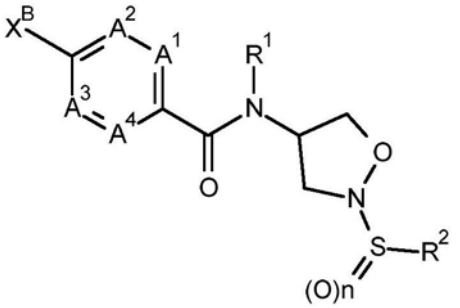
R^7独立地是卤素、氰基、C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基、C_1-C_8烷氧基、或C_1-C_8卤代烷氧基；

R^8和R^9独立地是氢、氰基、C_1-C_8烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷基、C_2-C_8烯基、苯

基-C_1-C_4烷基、-S(O)$_2R^{10}$；

R^{10}是C_1-C_8烷基。

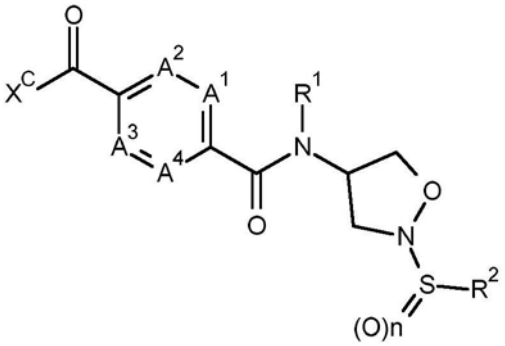
9.一种具有式(Int-I)的化合物



(Int-I)

其中，A^1、A^2、A^3、A^4、R^1、R^2和n是如对于根据权利要求1至8中任一项所述的化合物所定义的，并且X^B是离去基团；或其盐；或

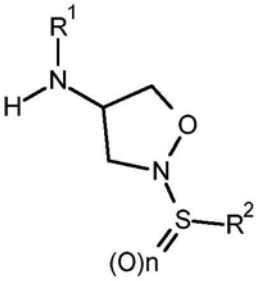
一种具有式(Int-II)的化合物



(Int-II)

其中，A^1、A^2、A^3、A^4、R^1、R^2和n是如对于根据权利要求1至8中任一项所述的化合物所定义的，并且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是如对于根据权利要求1至8中任一项所述的化合物所定义的；或其盐；或

一种具有式(Int-III)的化合物



(Int-III)

其中，R^1、R^2和n是如对于根据权利要求1至8中任一项所述的化合物所定义的；或其盐。

10.根据权利要求9的具有式(Int-I)的化合物，其中X^B是氰基、甲酰基、CH=N-OH或乙酰基。

11.一种用于对抗和/或控制无脊椎动物有害生物的方法，该方法包括向该有害生物、该有害生物的场所、或易受该有害生物攻击的植物施用杀有害生物有效量的如权利要求1至8中任一项中所定义的化合物，除了通过手术或疗法用于处理人或动物体的方法以及对于人或动物体实施的诊断方法之外。

12.一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8中

任一项所述的化合物作为活性成分，所述化合物在所有情况下为游离形式或农业化学上可利用的盐形式。

13.一种用于控制有害生物的方法，该方法包括将根据权利要求12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对于人或动物体实施的诊断方法之外。

14.一种用于保护植物繁殖材料免受有害生物攻击的方法，该方法包括用根据权利要求12所述的组合物处理该繁殖材料或该繁殖材料所种植的场所。

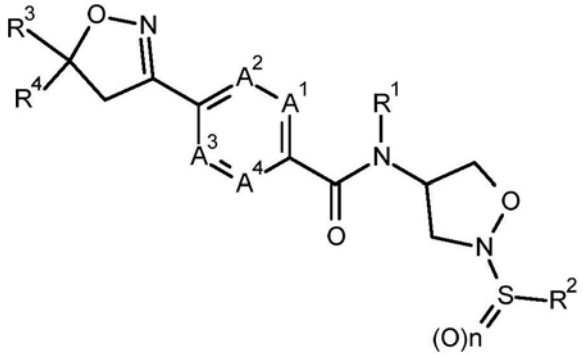
作为杀虫剂的异噁唑啉取代的苯甲酰胺和类似物

[0001] 本发明涉及某些异噁唑烷衍生物，涉及用于制备这些衍生物的方法与中间体，涉及包含这些衍生物的杀昆虫、杀螨、杀线虫和杀软体动物的组合物并且涉及使用这些衍生物控制昆虫、螨、线虫和软体动物有害生物的方法。

[0002] 某些具有杀昆虫特性的异噁唑啉衍生物披露于例如WO 2011067272中。

[0003] 现在已经出人意料地发现某些异噁唑烷衍生物具有高度有效的杀昆虫特性。

[0004] 在本发明的一个第一方面，本发明提供了具有式(I)的化合物

[0005]  (I)

[0006] 其中，

[0007] A^1、A^2、A^3以及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_1-C_8烷氧基、C_1-C_8烷氧基-C_1-C_8烷基或C_1-C_8烷氧基羰基-；

[0009] R^2是C_1-C_8烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8卤代烷基、C_3-C_8环烷基、被一个至三个R^{6b}取代的C_3-C_8环烷基、其中的一个碳原子被O、S、S(O)或SO_2替换的C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_8烷基、其中在该环烷基基团中的一个碳原子被O、S、S(O)或SO_2替换的C_3-C_8环烷基-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、被一个至三个R^{6a}取代的C_2-C_8烯基、C_2-C_8卤代烯基、被一个至三个R^{6a}取代的C_2-C_8卤代烯基、C_2-C_8炔基、C_2-C_8卤代炔基、苯基、被一个至三个R^7取代的苯基、苯基-C_1-C_4烷基、其中的该苯基部分被一个至三个R^7取代的苯基-C_1-C_4烷基、5-6元杂芳基、被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基、5-6元杂芳基-C_1-C_4烷基、其中的该杂芳基部分被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基-C_1-C_4烷基、-N(R^8)(R^9)、-OR^{10}或卤素；

[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-、或在相邻碳原子上的两个R^5一起形成-CH=CH-CH=CH-桥或-N=CH-CH=CH-桥；

[0013] R^{6a}独立地是氰基、硝基、氨基、C_1-C_8烷基氨基、N,N-C_1-C_8二烷基氨基、羟基、C_1-C_8烷氧基、或C_1-C_8卤代烷氧基；

[0014] R^{6b}独立地是卤素、氰基、硝基、氧代基(oxo)、C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基、氨基、C_1-C_8烷基氨基、N,N-C_1-C_8二烷基氨基、羟基、C_1-C_8烷氧基、C_1-C_8卤代烷氧基、苯基、被一个至三个

R^7取代的苯基、5-6元杂芳基、被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基；

[0015] 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；

[0016] R^8和R^9独立地是氢、氰基、氰基-C_1-C_8烷基、C_1-C_8烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷基、C_2-C_8烯基、被一个至三个R^{6a}取代的C_2-C_8烯基、C_1-C_8烷氧基、C_1-C_8卤代烷氧基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8卤代烷氧基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷氧基、C_1-C_8卤代烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8卤代烷基、C_3-C_8环烷基、被一个至三个R^{6b}取代的C_3-C_8环烷基、其中的一个碳原子被O、S、S(O)或SO_2替换的C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_8烷基、其中在该环烷基基团中的一个碳原子被O、S、S(O)或SO_2替换的C_3-C_8环烷基-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、被一个至三个R^{6a}取代的C_2-C_8烯基、C_2-C_8卤代烯基、被一个至三个R^{6a}取代的C_2-C_8卤代烯基、C_2-C_8炔基、C_2-C_8卤代炔基、苯基、被一个至三个R^7取代的苯基、苯基-C_1-C_4烷基、其中的该苯基部分被一个至三个R^7取代的苯基-C_1-C_4烷基、5-6元杂芳基、被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基、5-6元杂芳基-C_1-C_4烷基、其中的该杂芳基部分被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基-C_1-C_4烷基、-S(O)R^{10}、-S(O)$_2R^{10}$、COR^{10}、$COOR^{10}$，或者R^8和R^9连同氮原子一起可以通过C_3-C_8亚烷基链、被一个至三个R^{6b}取代的C_3-C_8亚烷基链或其中的一个碳原子被O、S、S(O)或SO_2替换的C_3-C_8亚烷基链进行连接；

[0017] R^{10}是氢、氰基-C_1-C_8烷基、C_1-C_8烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8卤代烷基、C_3-C_8环烷基、被一个至三个R^{6b}取代的C_3-C_8环烷基、其中的一个碳原子被O、S、S(O)或SO_2替换的C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_8烷基、其中在该环烷基基团中的一个碳原子被O、S、S(O)或SO_2替换的C_3-C_8环烷基-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、被一个至三个R^{6a}取代的C_2-C_8烯基、C_2-C_8卤代烯基、被一个至三个R^{6a}取代的C_2-C_8卤代烯基、C_2-C_8炔基、C_2-C_8卤代炔基、苯基、被一个至三个R^7取代的苯基、苯基-C_1-C_4烷基、其中的该苯基部分被一个至三个R^7取代的苯基-C_1-C_4烷基、5-6元杂芳基、被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基、5-6元杂芳基-C_1-C_4烷基或其中的该杂芳基部分被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基-C_1-C_4烷基；

[0018] n是1或2；

[0019] 或其互变异构体、异构体、对映异构体、盐或N-氧化物。

[0020] 具有至少一个碱性中心的具有式(I)的化合物可以与以下酸形成例如酸加成盐，这些酸为：例如强无机酸(诸如矿物酸，例如高氯酸、硫酸、硝酸、亚硝酸、磷酸或氢卤酸)，强有机羧酸(诸如未经取代的或例如被卤素取代的C_1-C_4链烷羧酸，例如乙酸(诸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(诸如羟基羧酸)，例如抗坏血酸、乳酸、苹果酸、酒石酸或柠檬酸，或诸如苯甲酸)，或有机磺酸(诸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，诸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，诸如吗啉、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。

[0021] 在取代基定义中出现的烷基基团可以是直链的或支链的，并且是例如甲基、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。

[0022] 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，诸如卤代烷基或卤代苯基。

[0023] 卤代烷基基团优选地具有从1至6个碳原子的链长。卤代烷基是例如氟甲基、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。

[0024] 烷氧基是例如甲氧基、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并且还是同分异构的戊氧基以及己氧基。

[0025] 烷氧基烷基基团优选地具有1个至6个碳原子的链长。

[0026] 烷氧基烷基是，例如甲氧基甲基、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。

[0027] 烷氧基羰基是例如甲氧基羰基(其为C_1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。

[0028] 环烷基基团优选地具有从3至6个环碳原子，例如环丙基、环丁基、环戊基和环己基。

[0029] 杂芳基基团优选地是5-6元杂芳基或是被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基，其中杂芳基基团包括1至3个选自下组的杂原子，该组由以下各项组成：氮、氧和硫，不可能每个环系统都含有多于2个氧原子以及多于2个硫原子。单环基团的实例包括吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、三唑基(例如，1,2,4-三唑基)、呋喃基、苯硫基、噁唑基、异噁唑基、噁二唑基、噻唑基、异噻唑基、四唑基以及噻二唑基。

[0030] 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。

[0031] A^1、A^2、A^3、A^4、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^{6a}、R^{6b}、R^7、R^8、R^9、和R^{10}相对于本发明的各种化合物(包括中间化合物)的优选值以任何组合(包括优选值和原始值的组合)是如以下列出的。

[0032] 优选地，A^1、A^2、A^3和A^4中不多于两个是氮。

[0033] 优选地，A^1是C-H或C-R^5；更优选地，A^1是C-R^5。

[0034] 优选地，A^2是C-H或C-R^5；更优选地，A^2是C-H。

[0035] 优选地，A^3是C-H或N；更优选地，A^3是C-H。

[0036] 优选地，A^4是C-H或N；更优选地，A^4是C-H。

[0037] 优选地，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-；更优选地是氢、甲基、乙基、甲基羰基-、或甲氧羰基-；最优选地是氢、甲基或乙基；尤其是氢或甲基；更尤其是氢。

[0038] 优选地，R^2是C_1-C_8烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷基、C_2-C_8烯基、C_2-C_8炔基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_8卤代烷基、二-C_1-C_8烷基氨基、-N(R^8)(R^9)、芳基、被一个至三个R^{6b}取代的芳基、5-6元杂芳基、被一个至三个R^{6b}取代的5-6元杂芳基或卤素；更优选地是C_1-C_4烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_4烷基、C_2-C_4烯基、C_2-C_4炔基、C_3-C_5环烷基、C_1-C_4卤代烷基、二-C_1-C_4烷基氨基、-N(R^8)(R^9)、1-3卤素取代的苯基、或5-6元杂芳基或氟；最优选地是甲基、乙基、环丙基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基、氟、二甲氨基或甲氨基。

[0039] 优选地，R^3是C_1-C_4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。

[0040] 优选地，R^4是芳基、被一个至三个R^7取代的芳基、5-6元杂芳基或被一个至三个R^7取代的5-6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。

[0041] 优选地，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、或在相邻碳原子上的两个R^5一起形成-CH=CH-CH=CH-桥；更优选地是卤素、氰基、硝基、C_1-C_8烷基、C2-C8烯基、C3-C8环烷基、或C_1-C_8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、三氟甲基、氟、或甲基。

[0042] 优选地，R^{6a}独立地是氰基、卤素、硝基、C_1-C_4烷氧基、或C_1-C_4卤代烷氧基；更优选地是氟、氰基、硝基、甲氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基。

[0043] 优选地，R^{6b}独立地是卤素、氰基、硝基、C_1-C_4烷基、或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；更优选地是溴、氯、氟、氰基、硝基、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基；最优选地是氯、氟、氰基、硝基、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、或三氟甲氧基；尤其是氯、氟、氰基、硝基、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、或三氟甲氧基；更尤其是溴、氟、氯、或三氟甲基。

[0044] 优选地，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；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_3、CH_3或OCF_3。

[0045] 优选地，R^8和R^9独立地是氢、氰基-C_1-C_8烷基、C_1-C_8烷基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_8卤代烷基、C_1-C_8烷氧基烷基、C_1-C_8羟基烷基、C_2-C_8烯基、C_2-C_8炔基、苯基-C_1-C_4烷基或其中的苯基部分被一个至三个R^7取代的苯基-C_1-C_4烷基、5-6元杂芳基-C_1-C_4烷基或其中的杂芳基部分被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基-C_1-C_4烷基；更优选地，R^8和R^9独立地是氢、氰基-C_1-C_8烷基-、C_1-C_8烷基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_8烷氧基烷基、C_1-C_8羟基烷基、C_2-C_8烯基、C_2-C_8炔基、苯基-C_1-C_4烷基或其中的苯基部分被一个至三个R^7取代的苯基-C_1-C_4烷基、5-6元杂芳基-C_1-C_4烷基或其中的杂芳基部分被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基-C_1-C_4烷基；仍甚至更优选地，R^8和R^9独立地是氢、C_1-C_4烷基、C_3-C_6环烷基、C_1-C_4卤代烷基、C_1-C_4羟基烷基、C_1-C_4烷氧基-C_1-C_4烷基、苯基-CH_2-或其中的苯基部分被一个至三个R^7取代的苯基-CH_2-、呋喃基或被一个至三个R^7取代的呋喃基、硫杂环丁烷基、氧杂环丁烷基、氧代-硫杂环丁烷基、或二氧代-硫杂环丁烷基；仍甚至更优选地，R^8和R^9独立地是氢、甲基、乙基、丙基、异丙基、环丙基、环丁基、氧杂环丁烷基、硫杂环丁烷基、三氟乙基、二氟乙基、烯丙基、炔丙基、氰基甲基、苄基、被一个至三个R^7取代的苄基、或吡啶-甲基-或被一个至三个R^7取代的吡啶-甲基-；尤其R^8和R^9独立地是氢和甲基。

[0046] 优选地，R^{10}各自独立地是氢、C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基或C_3-C_8环烷基，更优选地是氢、C_1-C_4烷基、C_1-C_4卤代烷基或C_3-C_6环烷基，最优选地是氢、甲基、乙基或环丙基。

[0047] 优选地，n是2。

[0048] 在式(I)的实施例E1中，独立于其他实施例，A^1是CR^5并且A^2、A^3和A^4各自是CH，其中R^5是如在本发明的第一方面中所定义的。

[0049] 在式(I)的实施例E2中，独立于其他实施例，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-。

[0050] 在式(I)的实施例E3中，独立于其他实施例，R^2是C_1-C_8烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷基、C_2-C_8烯基、C_2-C_8炔基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_8卤代烷基、二-C_1-C_8烷基氨基、-N(R^8)(R^9)、芳基、被一个至三个R^{6b}取代的芳基、5-6元杂芳基、被一个至三个R^{6b}取代的5-6元杂芳基，其中R^{6a}和R^{6b}是如在本发明的第一方面中所定义的或是卤素。

[0051] 在式(I)的实施例E4中，独立于其他实施例，R^3是C_1-C_4卤代烷基。

[0052] 在式(I)的实施例E5中，独立于其他实施例，R^4是芳基、被一个至三个R^7取代的芳基、5-6元杂芳基或被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基，其中R^7是如在本发明的第一方面中所定义的。

[0053] 式(I)的实施例E6提供了具有式(I)的化合物，其中A^1是CR^5并且A^2、A^3和A^4各自是CH；R^1是氢、甲基、乙基、甲基羰基-、或甲氧基羰基；R^2是C_1-C_8烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷基、C_2-C_8烯基、C_2-C_8炔基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_8卤代烷基、二-C_1-C_8烷基氨基、芳基、被一个至三个R^{6b}取代的芳基、5-6元杂芳基、被一个至三个R^{6b}取代的5-6元杂芳基或氟；R^3是C_1-C_4卤代烷基；R^4是芳基或被一个至三个R^7取代的芳基；并且n是2；其中R^5是卤素或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；R^{6a}独立地是氰基、卤素、硝基、C_1-C_4烷氧基、或C_1-C_4卤代烷氧基；并且R^{6b}独立地是卤素、氰基、硝基、C_1-C_4烷基、或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。

[0054] 式(I)的实施例E7提供了具有式(I)的化合物，其中A^1是CR^5并且A^2、A^3和A^4各自是CH；R^1是氢、甲基、乙基、甲基羰基-、或甲氧基羰基；R^2是C_1-C_4烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_4烷基、C_2-C_4烯基、C_2-C_4炔基、C_3-C_5环烷基、C_1-C_4卤代烷基、二-C_1-C_4烷基氨基、-NH(C_1-C_4烷基)、氟、苯基、或5-6元杂芳基；R^3是C_1-C_4卤代烷基；R^4是芳基或被一个至三个R^7取代的芳基；并且n是2；其中R^5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；R^{6a}独立地是氟、氰基、硝基、甲氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基；并且R^7独立地是溴、氯、氟、氰基、硝基、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基。

[0055] 式(I)的实施例E8提供了具有式(I)的化合物，其中A^1是CR^5并且A^2、A^3和A^4各自是CH；R^1是氢；R^2是C_1-C_4烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_4烷基、C_2-C_4烯基、C_2-C_4炔基、C_3-C_5环烷基、C_1-C_4卤代烷基、二-C_1-C_4烷基氨基、-NH(C_1-C_4烷基)、氟、1-3卤素取代的苯基、或5-6元杂芳基；R^3是氯二氟甲基或三氟甲基；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；并且n是2；其中R^5是溴、氯、氟、氰基、硝基、甲基、乙基、三氟甲基、环丙基、或乙烯基；R^{6a}独立地是氟、氰基、硝基、甲氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基；并且R^{6b}独立地是溴、氯、氟、氰基、硝基、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基。

[0056] 式(I)的实施例E9提供了具有式(I)的化合物，其中A^1是CR^5并且A^2、A^3和A^4各自是CH；R^1是氢；R^2是C_1-C_4烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_4烷基、C_2-C_4烯基、C_2-C_4炔基、C_3-C_5环

烷基、C_1-C_4卤代烷基、二-C_1-C_4烷基氨基、-NH(C_1-C_4烷基)、氟或5-6元杂芳基;R^3是氯二氟甲基或三氟甲基;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;并且n是2;其中R^5是溴、氯、氟、氰基、硝基、甲基、乙基、三氟甲基、环丙基、或乙烯基;R^{6a}独立地是氟、氰基、硝基、甲氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基;并且R^{6b}独立地是溴、氯、氟、氰基、硝基、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基。

[0057] 式(I)的实施例E10提供了具有式(I)的化合物,其中A^1是CR^5并且A^2、A^3和A^4各自是CH;R^1是氢;R^2是甲基、乙基、丙基、异丙基、环丙基、环丁基、氧杂环丁烷基、硫杂环丁烷基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟乙基、二氟乙基、烯丙基、炔丙基、氰基甲基、二甲氨基、甲氨基或氟;R^3是氯二氟甲基或三氟甲基;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;并且n是2;其中R^5是溴、氯、氟、氰基、硝基、甲基、乙基、三氟甲基、环丙基、或乙烯基;R6a独立地是氟、氰基、硝基、甲氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基;并且R^{6b}独立地是溴、氯、氟、氰基、硝基、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基。

[0058] 式(I)的实施例E11提供了具有式(I)的化合物,其中A^2、A^3和A^4各自是CH;R^1是氢;R^3是氯二氟甲基或三氟甲基;n是2;A^1是CR^5,其中R^5是氯、溴、三氟甲基、氟、或甲基;R^2是甲基、乙基、环丙基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基、异丙基、甲氨基、二甲氨基、氟、环丁基、3,3,3,-三氟丙基、或2,2,2-三氟乙基、或甲氧基乙基;并且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;尤其R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基、吡啶基、或3-5-取代的吡啶基,其中这些取代基选自溴、氯、氟或三氟;更优选地,R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基。

[0059] 式(I)的实施例E12提供了具有式(I)的化合物,其中A^2、A^3和A^4各自是CH;R^1是氢;R^3是三氟甲基;n是2;A^1是CR^5,其中R^5是氯或甲基;R^2是甲基、乙基、环丙基、甲氨基、二甲氨基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基或氟;并且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;尤其R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基、吡啶基、或3-5-取代的吡啶基,其中这些取代基选自溴、氯、氟或三氟;更优选地,R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基。

[0060] 式(I)的实施例E13提供了具有式(I)的化合物,其中A^2、A^3和A^4各自是CH;R^1是氢;R^3是氯二氟甲基或三氟甲基;n是2;A^1是CR^5,其中R^5是氯、溴、三氟甲基、氟、或甲基;R^2是甲基、乙基、环丙基、甲氨基、二甲氨基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基或氟;并且R^4是苯基、吡啶基、单-、双-或三取代的苯基(其中这些取代基独立地选自氯、溴、氟、或三氟甲基)、或单-或双

取代的吡啶基(其中这些取代基独立地选自氯、溴、氟、或三氟甲基)。

[0061] 式(I)的实施例E14提供了具有式(I)的化合物,其中A^2、A^3和A^4各自是CH;R^1是氢;R^3是三氟甲基;n是2;A^1是CR^5,其中R^5是氯或甲基;R^2是甲基、乙基、环丙基、甲氨基、二甲氨基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基或氟;并且R^4是3,5-二氯-4-氟苯基、3,4,5-三氯-苯基、3-溴-5-三氟甲基-苯基、3-氯-5-三氟甲基-苯基。

[0062] 式(I)的实施例E15提供了具有式(I)的化合物,其中A^2、A^3和A^4各自是CH;R^1是氢;R^3是氯二氟甲基或三氟甲基;n是2;A^1是CR^5,其中R^5是氯;R^2是甲基、乙基、环丙基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基、异丙基、甲氨基、二甲氨基、氟、环丁基、3,3,3,-三氟丙基、或2,2,2-三氟乙基、或甲氧基乙基;并且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;尤其R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基、吡啶基、或3-5-取代的吡啶基,其中这些取代基选自溴、氯、氟或三氟;更优选地,R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基。

[0063] 式(I)的实施例E16提供了具有式(I)的化合物,其中A^2、A^3和A^4各自是CH;R^1是氢;R^3是三氟甲基;n是2;A^1是CR^5,其中R^5是氯;R^2是甲基、乙基、环丙基、甲氨基、二甲氨基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基或氟;并且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;尤其R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基、吡啶基、或3-5-取代的吡啶基,其中这些取代基选自溴、氯、氟或三氟;更优选地,R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基。

[0064] 式(I)的实施例E17提供了具有式(I)的化合物,其中A^2、A^3和A^4各自是CH;R^1是氢;R^3是氯二氟甲基或三氟甲基;n是2;A^1是CR^5,其中R^5是氯;R^2是甲基、乙基、环丙基、甲氨基、二甲氨基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基或氟;并且R^4是苯基、吡啶基、单-、双-或三取代的苯基(其中这些取代基独立地选自氯、溴、氟、或三氟甲基)、或单-或双取代的吡啶基(其中这些取代基独立地选自氯、溴、氟、或三氟甲基)。

[0065] 式(I)的实施例E18提供了具有式(I)的化合物,其中A^2、A^3和A^4各自是CH;R^1是氢;R^3是三氟甲基;n是2;A^1是CR^5,其中R^5是氯;R^2是甲基、乙基、环丙基、甲氨基、二甲氨基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基或氟;并且R^4是3,5-二氯-4-氟苯基、3,4,5-三氯-苯基、3-溴-5-三氟甲基-苯基、3-氯-5-三氟甲基-苯基。

[0066] 式(I)的实施例E19提供了具有式(I)的化合物,其中A^2、A^3和A^4各自是CH;R^1是氢;R^3是氯二氟甲基或三氟甲基;n是2;A^1是CR^5,其中R^5是溴;R^2是甲基、乙基、环丙基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基、异丙基、甲氨基、二甲氨基、氟、环丁基、3,3,3,-三氟丙基、或2,2,2-三氟乙基、或甲氧基乙基;并且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;尤其R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二

氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基、吡啶基、或3-5-取代的吡啶基，其中这些取代基选自溴、氯、氟或三氟；更优选地，R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基。

[0067] 式(I)的实施例E20提供了具有式(I)的化合物，其中A^2、A^3和A^4各自是CH；R^1是氢；R^3是三氟甲基；n是2；A^1是CR^5，其中R^5是溴；R^2是甲基、乙基、环丙基、甲氨基、二甲氨基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基或氟；并且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；尤其R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基、吡啶基、或3-5-取代的吡啶基，其中这些取代基选自溴、氯、氟或三氟；更优选地，R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基。

[0068] 式(I)的实施例E21提供了具有式(I)的化合物，其中A^2、A^3和A^4各自是CH；R^1是氢；R^3是氯二氟甲基或三氟甲基；n是2；A^1是CR^5，其中R^5是溴；R^2是甲基、乙基、环丙基、甲氨基、二甲氨基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基或氟；并且R^4是苯基、吡啶基、单-、双-或三取代的苯基(其中这些取代基独立地选自氯、溴、氟、或三氟甲基)、或单-或双取代的吡啶基(其中这些取代基独立地选自氯、溴、氟、或三氟甲基)。

[0069] 式(I)的实施例E22供了具有式(I)的化合物，其中A^2、A^3和A^4各自是CH；R^1是氢；R^3是三氟甲基；n是2；A^1是CR^5，其中R^5是溴；R^2是甲基、乙基、环丙基、甲氨基、二甲氨基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基或氟；并且R^4是3,5-二氯-4-氟苯基、3,4,5-三氯-苯基、3-溴-5-三氟甲基-苯基、3-氯-5-三氟甲基-苯基。

[0070] 式(I)的实施例E23供了具有式(I)的化合物，其中A^2、A^3和A^4各自是CH；R^1是氢；R^3是氯二氟甲基或三氟甲基；n是2；A^1是CR^5，其中R^5是甲基；R^2是甲基、乙基、环丙基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基、异丙基、甲氨基、二甲氨基、氟、环丁基、3,3,3,-三氟丙基、或2,2,2-三氟乙基、或甲氧基乙基；并且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；尤其R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基、吡啶基、或3-5-取代的吡啶基，其中这些取代基选自溴、氯、氟或三氟；更优选地，R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基。

[0071] 式(I)的实施例E24供了具有式(I)的化合物，其中A^2、A^3和A^4各自是CH；R^1是氢；R^3是三氟甲基；n是2；A^1是CR^5，其中R^5是甲基；R^2是甲基、乙基、环丙基、甲氨基、二甲氨基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基或氟；并且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；尤其R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基、吡啶基、或3-5-取代的吡啶基，其中这些取代基选自溴、氯、氟或三氟；更优选

地，R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基。

[0072] 式(I)的实施例E25提供了具有式(I)的化合物，其中A^2、A^3和A^4各自是CH；R^1是氢；R^3是氯二氟甲基或三氟甲基；n是2；A^1是CR^5，其中R^5是甲基；R^2是甲基、乙基、环丙基、甲氨基、二甲氨基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基或氟；并且R^4是苯基、吡啶基、单-、双-或三取代的苯基(其中这些取代基独立地选自氯、溴、氟、或三氟甲基)、或单-或双取代的吡啶基(其中这些取代基独立地选自氯、溴、氟、或三氟甲基)。

[0073] 式(I)的实施例E26供了具有式(I)的化合物，其中A^2、A^3和A^4各自是CH；R^1是氢；R^3是三氟甲基；n是2；A^1是CR^5，其中R^5是甲基；R^2是甲基、乙基、环丙基、甲氨基、二甲氨基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基或氟；并且R^4是3,5-二氯-4-氟苯基、3,4,5-三氯-苯基、3-溴-5-三氟甲基-苯基、3-氯-5-三氟甲基-苯基。

[0074] 式(I)的实施例E27提供了具有式(I)的化合物，其中A^2、A^3和A^4各自是CH；R^1是氢；R^3是氯二氟甲基或三氟甲基；n是2；A^1是CR^5，其中R^5是三氟甲基；R^2是甲基、乙基、环丙基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基、异丙基、甲氨基、二甲氨基、氟、环丁基、3,3,3,-三氟丙基、或2,2,2-三氟乙基、或甲氧基乙基；并且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；尤其R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基、吡啶基、或3-5-取代的吡啶基，其中这些取代基选自溴、氯、氟或三氟；更优选地，R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基。

[0075] 式(I)的实施例E28提供了具有式(I)的化合物，其中A^2、A^3和A^4各自是CH；R^1是氢；R^3是三氟甲基；n是2；A^1是CR^5，其中R^5是三氟甲基；R^2是甲基、乙基、环丙基、甲氨基、二甲氨基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基或氟；并且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；尤其R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基、吡啶基、或3-5-取代的吡啶基，其中这些取代基选自溴、氯、氟或三氟；更优选地，R^4是3,5-二溴-苯基、3,5-二氯-苯基、3,5-双-(三氟甲基)-苯基、4-溴-3,5-二氯苯基、3,4,5-三氯-苯基、3,5-二氯-4-氟苯基。

[0076] 式(I)的实施例E29提供了具有式(I)的化合物，其中A^2、A^3和A^4各自是CH；R^1是氢；R^3是氯二氟甲基或三氟甲基；n是2；A^1是CR^5，其中R^5是三氟甲基；R^2是甲基、乙基、环丙基、甲氨基、二甲氨基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基或氟；并且R^4是苯基、吡啶基、单-、双-或三取代的苯基(其中这些取代基独立地选自氯、溴、氟、或三氟甲基)、或单-或双取代的吡啶基(其中这些取代基独立地选自氯、溴、氟、或三氟甲基)。

[0077] 式(I)的实施例E30提供了具有式(I)的化合物，其中A^2、A^3和A^4各自是CH；R^1是氢；R^3是三氟甲基；n是2；A^1是CR^5，其中R^5是三氟甲基；R^2是甲基、乙基、环丙基、甲氨基、二甲氨基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基或氟；并且R^4是3,5-二氯-4-氟苯基、3,4,5-三氯-苯基、3-溴-5-三氟甲基-苯基、3-氯-5-三氟甲基-苯基。

[0078] 式(I)的一个优选实施例提供了具有式(I)的化合物,其中

[0079] A^1、A^2、A^3以及A^4彼此独立地是C-H、C-R^5、或氮;

[0080] R^1是氢;

[0081] R^2是C_1-C_8烷基或被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基或被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8卤代烷基、C_3-C_8环烷基或被一个至三个R^{6b}取代的C_3-C_8环烷基、苯基、被一个至三个R^7取代的苯基、苯基-C_1-C_4烷基、其中的苯基部分被一个至三个R^7取代的苯基-C_1-C_4烷基、5-6元杂芳基、被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基、-N(R^8)(R^9)或氟;

[0082] R^3是C_1-C_8卤代烷基;

[0083] R^4是苯基或被一个至三个R^7取代的苯基;

[0084] 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;

[0085] R^{6a}独立地是C_1-C_8烷氧基、或C_1-C_8卤代烷氧基;

[0086] R^{6b}独立地是氧代基、氨基、C_1-C_8烷基氨基、N,N-C_1-C_8二烷基氨基、C_1-C_8烷氧基、C_1-C_8卤代烷氧基、苯基、被一个至三个R^7取代的苯基、5-6元杂芳基或被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基;

[0087] R^7独立地是卤素、氰基、C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基、C_1-C_8烷氧基、或C_1-C_8卤代烷氧基;

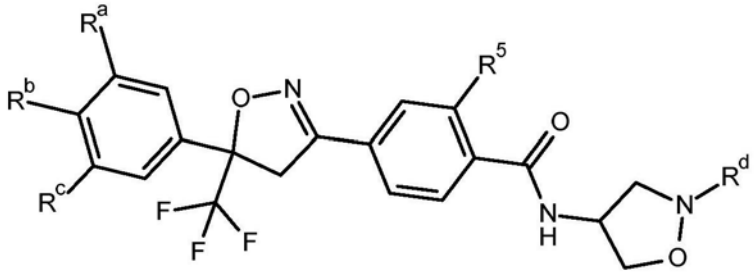
[0088] R^8和R^9独立地是氢、氰基-C_1-C_8烷基、C_1-C_8烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷基、C_2-C_8烯基或被一个至三个R^{6a}取代的C_2-C_8烯基、苯基-C_1-C_4烷基、其中的该苯基部分被一个至三个R^7取代的苯基-C_1-C_4烷基、-S(O)$_2$$R^{10}$;

[0089] R^{10}是氢、氰基-C_1-C_8烷基、C_1-C_8烷基或被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷基、苯基、被一个至三个R^7取代的苯基、5-6元杂芳基、被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基;

[0090] n是2;

[0091] 或其互变异构体、同分异构体、对映异构体、盐或N-氧化物。

[0092] 同样尤其优选的具有式(I)的化合物由具有式(Ib)的化合物表示

[0093] 

(Ib)

[0094] 其中

[0095] R^a是氢、卤素、氰基、C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基、或C_1-C_8卤代烷氧基;

[0096] R^b是氢、卤素、氰基、C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基、或C_1-C_8卤代烷氧基;

[0097] R^c是氢、卤素、氰基、C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基、或C_1-C_8卤代烷氧基;

[0098] R^5是卤素、氰基、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;

[0099] R^d是S(O)$_2$-R^2;

[0100] R^2是C_1-C_8烷基或被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基或被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8卤代烷基、C_3-C_8环烷基或被一个至三个R^{6b}取代的C_3-C_8环烷基、苯基、被一个至三个R^7取代的苯基、苯基-C_1-C_4烷基、其中的该苯基部分被一个至三个R^7取代的苯基-

C_1-C_4烷基、5-6元杂芳基、被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基、-N(R^8)(R^9)、卤素；

[0101] 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；

[0102] R^{6a}独立地是C_1-C_8烷氧基、或C_1-C_8卤代烷氧基；

[0103] R^{6b}独立地是氧代基、氨基、C_1-C_8烷基氨基、N,N-C_1-C_8二烷基氨基、C_1-C_8烷氧基、C_1-C_8卤代烷氧基、苯基、被一个至三个R^7取代的苯基、5-6元杂芳基或被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基；

[0104] R^7独立地是卤素、氰基、C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基、C_1-C_8烷氧基、或C_1-C_8卤代烷氧基；

[0105] R^8和R^9独立地是氢、氰基-C_1-C_8烷基、C_1-C_8烷基、被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷基、C_2-C_8烯基或被一个至三个R^{6a}取代的C_2-C_8烯基、苯基-C_1-C_4烷基、其中的该苯基部分被一个至三个R^7取代的苯基-C_1-C_4烷基、-S(O)$_2R^{10}$；

[0106] R^{10}是氢、氰基-C_1-C_8烷基、C_1-C_8烷基或被一个至三个R^{6a}取代的C_1-C_8烷基、苯基、被一个至三个R^7取代的苯基、5-6元杂芳基、被一个至三个R^7取代的5-6元杂芳基。优选地，R^a、R^b以及R^c中的至少一个不是氢。

[0107] 更优选地

[0108] R^a是氢、卤素、氰基、C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基、或C_1-C_8卤代烷氧基；

[0109] R^b是氢、卤素、氰基、C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基、或C_1-C_8卤代烷氧基；

[0110] R^c是氢、卤素、氰基、C_1-C_8烷基、C_1-C_8卤代烷基、或C_1-C_8卤代烷氧基；

[0111] R^5是卤素、氰基、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；

[0112] R^d是SO_2-CH_3、SO_2-4-氯苯基、SO_2-丙基、SO_2-CH_2Cl、SO_2-CH_2F、SO_2-CHF_2、SO_2-环丙基、SO_2-CH_2CH_2-Cl、SO_2-CH_2CF_3、SO_2-2-噻吩基、SO_2-N(CH_3)$_2$、SO_2-$CH_2CH_2CF_3$、SO_2-环丁基、SO_2-2-丙基、SO_2-CH_2CH_2-O-CH_3、$SO_2CH_2CH_3$、SO_2F、SO_2-NH_2、SO_2-NH(CH_3)、SO_2-N(CH_3)(CH_2CH_3)、SO_2-N(CH_3)(C(=O)CH_3)、SO_2-N(CH_3)C(=O)N(CH_3)$_2$、SO_2-N(CH_3)C(=O)OCH_2CH_3、SO_2-N(CH_3)C(=O)OCH_3、SO_2-N(CH_3)C(=O)(3-吡啶基)、SO_2-N(CH_3)SO_2N(CH_3)$_2$、SO_2-N(CH_3)C(=O)Ph、SO_2-N(CH_3)CN、SO_2-N(CH_3)CH_2CHCH_2、SO_2-N(CH_3)CH_2COCH_2、SO_2-N(CH_3)$CH_2CH_2CH_3$、SO_2-N(CH_3)$CH_2CH_2CH_2CH_3$、SO_2-N(CH_3)CH_2Ph、SO_2-N(CH_3)CH_2CN、SO_2-N(CH_3)$CH_2CO2CH_2CH_3$、SO_2-N(CH_3)$CH_2CH_2OCH_3$、SO_2-N(CH_2CH_3)CO2C(CH_3)$_3$、SO_2-N(CH_3)SO_2CH_3、SO_2-NHCH_2CH_3、SO_2-N(CH_3)CH_2OCH_3、SO_2-NHC(CH_3)$_3$、SO_2-N(CH_2CH_3)2、SO_2-N(CH_2)$_4$、SO_2-N(CH_3)C(CH_3)$_3$、SO_2-NHCH(CH_3)$_2$、SO_2-NHC(=O)CH_3、SO_2-NHSO_2CH_3、SO_2-N(CH_3)CH(CH_3)$_2$、SO_2-N(CH_2CH_3)CH(CH_3)$_2$或SO_2-$NHCH_2CHCH_2$。优选地，R^a、R^b以及R^c中的至少一个不是氢。更优选地，Ra、Rb以及Rc中的至少两个不是氢。

[0113] 同样更优选地，

[0114] R^a是H、Cl、Br、F、CF_3、CH_3或OCF_3；

[0115] R^b是H、Cl、Br、F、CF_3、CH_3或OCF_3；

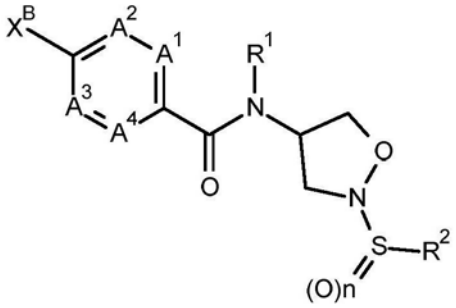
[0116] R^c是H、Cl、Br、F、CF_3、CH_3或OCF_3；

[0117] R^5是CH_3、Cl、Br、CN、环丙基、CF_3、$CHCH_2$；

[0118] R^d是SO_2-CH_3、SO_2-4-氯苯基、SO_2-丙基、SO_2-CH_2Cl、SO_2-CH_2F、SO_2-CHF_2、SO2-环丙基、SO_2-CH_2CH_2-Cl、SO_2-CH_2CF_3、SO_2-2-噻吩基、SO_2-N(CH_3)$_2$、SO_2-$CH_2CH_2CF_3$、SO_2-环丁基、SO_2-2-丙基、SO_2-CH_2CH_2-O-CH_3、$SO_2CH_2CH_3$、SO_2F、SO_2-NH_2、SO_2-NH(CH_3)、SO_2-N(CH_3)(CH_2CH_3)、SO_2-N(CH_3)(C(=O)CH_3)、SO_2-N(CH_3)C(=O)N(CH_3)$_2$、SO_2-N(CH_3)C(=O)OCH_2CH_3、SO_2-N(CH_3)C(=O)

OCH_3、SO_2-N(CH_3)C(=O)(3-吡啶基)、SO_2-N(CH_3)$SO_2N(CH_3)_2$、SO_2-N(CH_3)C(=O)Ph、SO_2-N(CH_3)CN、SO_2-N(CH_3)CH_2CHCH_2、SO_2-N(CH_3)CH_2COCH_2、SO_2-N(CH_3)$CH_2CH_2CH_3$、SO_2-N(CH_3)$CH_2CH_2CH_2CH_3$、SO_2-N(CH_3)CH_2Ph、SO_2-N(CH_3)CH_2CN、SO_2-N(CH_3)$CH_2CO2CH_2CH_3$、SO_2-N(CH_3)$CH_2CH_2OCH_3$、SO_2-N(CH_2CH_3)CO2C(CH_3)$_3$、SO_2-N(CH_3)SO_2CH_3、SO_2-NHCH_2CH_3、SO_2-N(CH_3)CH_2OCH_3、SO_2-NHC(CH_3)$_3$、SO_2-N(CH_2CH_3)2、SO_2-N(CH_2)$_4$、SO_2-N(CH_3)C(CH_3)$_3$、SO_2-NHCH(CH_3)$_2$、SO_2-NHC(=O)CH_3、SO_2-NHSO_2CH_3、SO_2-N(CH_3)CH(CH_3)$_2$、SO_2-N(CH_2CH_3)CH(CH_3)$_2$或SO_2-NHCH_2CHCH_2。优选地，R^a、R^b以及R^c中的至少一个不是氢。更优选地，Ra、Rb以及Rc中的至少两个不是氢。

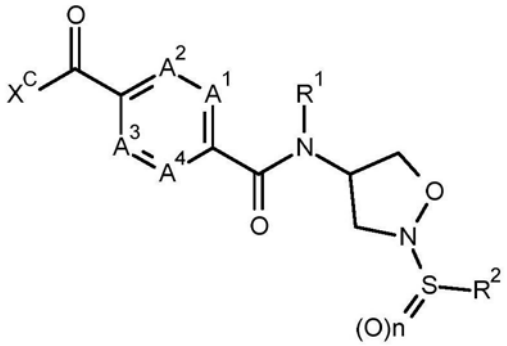
[0119] 本发明还提供了有用于制备具有式(I)的化合物的中间体。某些中间体是新颖的并且如此形成本发明的另一个方面。一组新颖中间体是具有式(Int-I)的化合物

[0120] 

(Int-I)

[0121] 其中A^1、A^2、A^3、A^4、R^1、R^2和n是如对于具有式(I)的化合物所定义的，并且X^B是卤素，诸如溴，或X^B是氰基、甲酰基、CH=N-OH或乙酰基；或其盐或N-氧化物。对于A^1、A^2、A^3、A^4、R^1、R^2和n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。

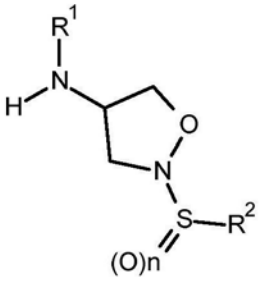
[0122] 另一组新颖中间体是具有式(Int-II)的化合物

[0123] 

(Int-II)

[0124] 其中A^1、A^2、A^3、A^4、R^1、R^2和n是如对于具有式(I)的化合物所定义的；X^C是CH_2-卤素，其中卤素优选地是溴或氯、CH=C(R^3)R^4或1OCH_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；或其盐或N-氧化物。对于A^1、A^2、A^3、A^4、R^1、R^2和n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。

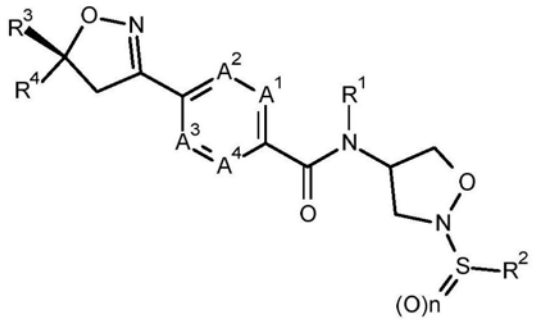
[0125] 另一组新颖中间体是具有式(Int-III)的化合物

[0126] 

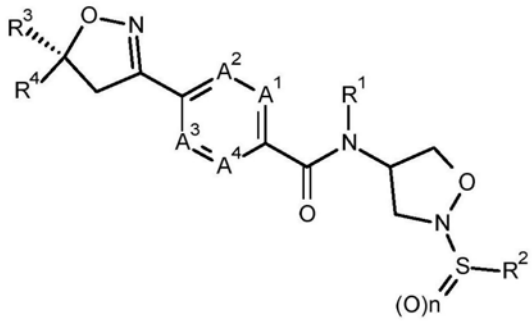
(Int-III)

[0127] 其中R^1、R^2和n是如对于具有式(I)的化合物所定义的;或其盐或N-氧化物。对于R^1、R^2和n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。

[0128] 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] 

(I*)

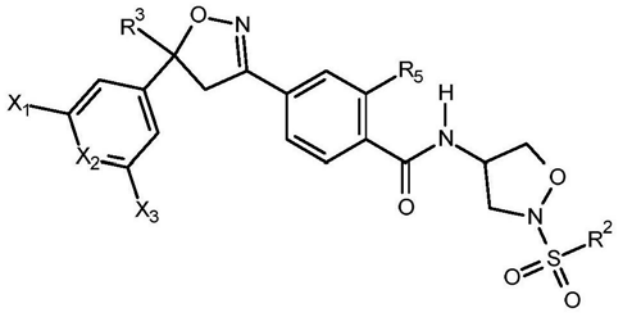


(I**)

[0130] 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。

[0131] 表1至表96:具有式(Ia)的化合物

[0132] 通过使以下在下表1至表96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。

[0133] 

(Ia)

[0134] 在以下的表P下面的表1至表96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^2和X_2是在有关的表1至表96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^2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^2和X_2取代基是如在表2中所定义的。表3至表96以此类推。

[0135] 在表1至表96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。

[0136] 表P

[0137]

	X_3	R^3	X_1	R^5
1	H	CF_3	H	Me
2	Cl	CF_3	H	Me
3	Br	CF_3	H	Me
4	F	CF_3	H	Me
5	CF_3	CF_3	H	Me
6	H	CF_2Cl	H	Me
7	Cl	CF_2Cl	H	Me
8	Br	CF_2Cl	H	Me
9	F	CF_2Cl	H	Me
10	CF_3	CF_2Cl	H	Me
11	H	CF_3	Cl	Me
12	Cl	CF_3	Cl	Me
13	Br	CF_3	Cl	Me
14	F	CF_3	Cl	Me
15	CF_3	CF_3	Cl	Me
16	H	CF_2Cl	Cl	Me
17	Cl	CF_2Cl	Cl	Me
18	Br	CF_2Cl	Cl	Me
19	F	CF_2Cl	Cl	Me
20	CF_3	CF_2Cl	Cl	Me
21	H	CF_3	Br	Me
22	Cl	CF_3	Br	Me
23	Br	CF_3	Br	Me
24	F	CF_3	Br	Me
25	CF_3	CF_3	Br	Me
26	H	CF_2Cl	Br	Me
27	Cl	CF_2Cl	Br	Me
28	Br	CF_2Cl	Br	Me
29	F	CF_2Cl	Br	Me
30	CF_3	CF_2Cl	Br	Me
31	H	CF_3	F	Me
32	Cl	CF_3	F	Me
33	Br	CF_3	F	Me
34	F	CF_3	F	Me
35	CF_3	CF_3	F	Me
36	H	CF_2Cl	F	Me
37	Cl	CF_2Cl	F	Me
38	Br	CF_2Cl	F	Me
39	F	CF_2Cl	F	Me
40	CF_3	CF_2Cl	F	Me
41	H	CF_3	CF_3	Me
42	Cl	CF_3	CF_3	Me
43	Br	CF_3	CF_3	Me
44	F	CF_3	CF_3	Me
45	CF_3	CF_3	CF_3	Me
46	H	CF_2Cl	CF_3	Me
47	Cl	CF_2Cl	CF_3	Me
48	Br	CF_2Cl	CF_3	Me
49	F	CF_2Cl	CF_3	Me
50	CF_3	CF_2Cl	CF_3	Me
51	H	CF_3	H	Cl
52	Cl	CF_3	H	Cl
53	Br	CF_3	H	Cl
54	F	CF_3	H	Cl
55	CF_3	CF_3	H	Cl
56	H	CF_2Cl	H	Cl
57	Cl	CF_2Cl	H	Cl
58	Br	CF_2Cl	H	Cl
59	F	CF_2Cl	H	Cl
60	CF_3	CF_2Cl	H	Cl
61	H	CF_3	Cl	Cl
62	Cl	CF_3	Cl	Cl
63	Br	CF_3	Cl	Cl
64	F	CF_3	Cl	Cl
65	CF_3	CF_3	Cl	Cl
66	H	CF_2Cl	Cl	Cl
67	Cl	CF_2Cl	Cl	Cl
68	Br	CF_2Cl	Cl	Cl
69	F	CF_2Cl	Cl	Cl
70	CF_3	CF_2Cl	Cl	Cl
71	H	CF_3	Br	Cl
72	Cl	CF_3	Br	Cl
73	Br	CF_3	Br	Cl
74	F	CF_3	Br	Cl
75	CF_3	CF_3	Br	Cl
76	H	CF_2Cl	Br	Cl
77	Cl	CF_2Cl	Br	Cl
78	Br	CF_2Cl	Br	Cl
79	F	CF_2Cl	Br	Cl
80	CF_3	CF_2Cl	Br	Cl
81	H	CF_3	F	Cl
82	Cl	CF_3	F	Cl
83	Br	CF_3	F	Cl
84	F	CF_3	F	Cl
85	CF_3	CF_3	F	Cl
86	H	CF_2Cl	F	Cl
87	Cl	CF_2Cl	F	Cl
88	Br	CF_2Cl	F	Cl
89	F	CF_2Cl	F	Cl
90	CF_3	CF_2Cl	F	Cl
91	H	CF_3	CF_3	Cl
92	Cl	CF_3	CF_3	Cl

[0138]

	X_3	R^3	X_1	R^5
93	Br	CF_3	CF_3	Cl
94	F	CF_3	CF_3	Cl
95	CF_3	CF_3	CF_3	Cl
96	H	CF_2Cl	CF_3	Cl
97	Cl	CF_2Cl	CF_3	Cl
98	Br	CF_2Cl	CF_3	Cl
99	F	CF_2Cl	CF_3	Cl
100	CF_3	CF_2Cl	CF_3	Cl
101	H	CF_3	H	Br
102	Cl	CF_3	H	Br
103	Br	CF_3	H	Br
104	F	CF_3	H	Br
105	CF_3	CF_3	H	Br
106	H	CF_2Cl	H	Br
107	Cl	CF_2Cl	H	Br
108	Br	CF_2Cl	H	Br
109	F	CF_2Cl	H	Br
110	CF_3	CF_2Cl	H	Br
111	H	CF_3	Cl	Br
112	Cl	CF_3	Cl	Br
113	Br	CF_3	Cl	Br
114	F	CF_3	Cl	Br
115	CF_3	CF_3	Cl	Br
116	H	CF_2Cl	Cl	Br
117	Cl	CF_2Cl	Cl	Br
118	Br	CF_2Cl	Cl	Br
119	F	CF_2Cl	Cl	Br
120	CF_3	CF_2Cl	Cl	Br
121	H	CF_3	Br	Br
122	Cl	CF_3	Br	Br
123	Br	CF_3	Br	Br
124	F	CF_3	Br	Br
125	CF_3	CF_3	Br	Br
126	H	CF_2Cl	Br	Br
127	Cl	CF_2Cl	Br	Br
128	Br	CF_2Cl	Br	Br
129	F	CF_2Cl	Br	Br
130	CF_3	CF_2Cl	Br	Br
131	H	CF_3	F	Br
132	Cl	CF_3	F	Br
133	Br	CF_3	F	Br
134	F	CF_3	F	Br
135	CF_3	CF_3	F	Br
136	H	CF_2Cl	F	Br
137	Cl	CF_2Cl	F	Br
138	Br	CF_2Cl	F	Br
139	F	CF_2Cl	F	Br

	X_3	R^3	X_1	R^5
140	CF_3	CF_2Cl	F	Br
141	H	CF_3	CF_3	Br
142	Cl	CF_3	CF_3	Br
143	Br	CF_3	CF_3	Br
144	F	CF_3	CF_3	Br
145	CF_3	CF_3	CF_3	Br
146	H	CF_2Cl	CF_3	Br
147	Cl	CF_2Cl	CF_3	Br
148	Br	CF_2Cl	CF_3	Br
149	F	CF_2Cl	CF_3	Br
150	CF_3	CF_2Cl	CF_3	Br
151	H	CF_3	H	CF_3
152	Cl	CF_3	H	CF_3
153	Br	CF_3	H	CF_3
154	F	CF_3	H	CF_3
155	CF_3	CF_3	H	CF_3
156	H	CF_2Cl	H	CF_3
157	Cl	CF_2Cl	H	CF_3
158	Br	CF_2Cl	H	CF_3
159	F	CF_2Cl	H	CF_3
160	CF_3	CF_2Cl	H	CF_3
161	H	CF_3	Cl	CF_3
162	Cl	CF_3	Cl	CF_3
163	Br	CF_3	Cl	CF_3
164	F	CF_3	Cl	CF_3
165	CF_3	CF_3	Cl	CF_3
166	H	CF_2Cl	Cl	CF_3
167	Cl	CF_2Cl	Cl	CF_3
168	Br	CF_2Cl	Cl	CF_3
169	F	CF_2Cl	Cl	CF_3
170	CF_3	CF_2Cl	Cl	CF_3
171	H	CF_3	Br	CF_3
172	Cl	CF_3	Br	CF_3
173	Br	CF_3	Br	CF_3
174	F	CF_3	Br	CF_3
175	CF_3	CF_3	Br	CF_3
176	H	CF_2Cl	Br	CF_3
177	Cl	CF_2Cl	Br	CF_3
178	Br	CF_2Cl	Br	CF_3
179	F	CF_2Cl	Br	CF_3
180	CF_3	CF_2Cl	Br	CF_3
181	H	CF_3	F	CF_3
182	Cl	CF_3	F	CF_3
183	Br	CF_3	F	CF_3
184	F	CF_3	F	CF_3
185	CF_3	CF_3	F	CF_3
186	H	CF_2Cl	F	CF_3

[0139]

	X_3	R^3	X_1	R^5
187	Cl	CF_2Cl	F	CF_3
188	Br	CF_2Cl	F	CF_3
189	F	CF_2Cl	F	CF_3
190	CF_3	CF_2Cl	F	CF_3
191	H	CF_3	CF_3	CF_3
192	Cl	CF_3	CF_3	CF_3
193	Br	CF_3	CF_3	CF_3
194	F	CF_3	CF_3	CF_3
195	CF_3	CF_3	CF_3	CF_3
196	H	CF_2Cl	CF_3	CF_3
197	Cl	CF_2Cl	CF_3	CF_3
198	Br	CF_2Cl	CF_3	CF_3
199	F	CF_2Cl	CF_3	CF_3
200	CF_3	CF_2Cl	CF_3	CF_3
201	H	CF_3	H	F
202	Cl	CF_3	H	F
203	Br	CF_3	H	F
204	F	CF_3	H	F
205	CF_3	CF_3	H	F
206	H	CF_2Cl	H	F
207	Cl	CF_2Cl	H	F
208	Br	CF_2Cl	H	F
209	F	CF_2Cl	H	F
210	CF_3	CF_2Cl	H	F
211	H	CF_3	Cl	F
212	Cl	CF_3	Cl	F
213	Br	CF_3	Cl	F
214	F	CF_3	Cl	F
215	CF_3	CF_3	Cl	F
216	H	CF_2Cl	Cl	F
217	Cl	CF_2Cl	Cl	F
218	Br	CF_2Cl	Cl	F
219	F	CF_2Cl	Cl	F
220	CF_3	CF_2Cl	Cl	F
221	H	CF_3	Br	F
222	Cl	CF_3	Br	F
223	Br	CF_3	Br	F
224	F	CF_3	Br	F
225	CF_3	CF_3	Br	F
226	H	CF_2Cl	Br	F
227	Cl	CF_2Cl	Br	F
228	Br	CF_2Cl	Br	F
229	F	CF_2Cl	Br	F
230	CF_3	CF_2Cl	Br	F
231	H	CF_3	F	F
232	Cl	CF_3	F	F
233	Br	CF_3	F	F
234	F	CF_3	F	F
235	CF_3	CF_3	F	F
236	H	CF_2Cl	F	F
237	Cl	CF_2Cl	F	F
238	Br	CF_2Cl	F	F
239	F	CF_2Cl	F	F
240	CF_3	CF_2Cl	F	F
241	H	CF_3	CF_3	F
242	Cl	CF_3	CF_3	F
243	Br	CF_3	CF_3	F
244	F	CF_3	CF_3	F
245	CF_3	CF_3	CF_3	F
246	H	CF_2Cl	CF_3	F
247	Cl	CF_2Cl	CF_3	F
248	Br	CF_2Cl	CF_3	F
249	F	CF_2Cl	CF_3	F
250	CF_3	CF_2Cl	CF_3	F

[0140] 表1

[0141] 表1提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是N，R^2是Me，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在

表P中所定义的。

[0142] 表2

[0143] 表2提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是CH，R^2是Me，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0144] 表3

[0145] 表3提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-F，R^2是Me，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0146] 表4

[0147] 表4提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Br，R^2是Me，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0148] 表5

[0149] 表5提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Cl，R^2是Me，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0150] 表6

[0151] 表6提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-CF_3，R^2是Me，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0152] 表7

[0153] 表7提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是N，R^2是Et，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0154] 表8

[0155] 表8提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是CH，R^2是Et，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0156] 表9

[0157] 表9提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-F，R^2是Et，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0158] 表10

[0159] 表10提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Br，R^2是Et，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0160] 表11

[0161] 表11提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Cl，R^2是Et，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0162] 表12

[0163] 表12提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-CF_3，R^2是Et，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0164] 表13

[0165] 表13提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是N，R^2是Pr，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0166] 表14

[0167] 表14提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是CH，R^2是Pr，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如

在表P中所定义的。

[0168] 表15

[0169] 表15提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-F，R^2是Pr，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0170] 表16

[0171] 表16提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Br，R^2是Pr，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0172] 表17

[0173] 表17提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Cl，R^2是Pr，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0174] 表18

[0175] 表18提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-CF_3，R^2是Pr，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0176] 表19

[0177] 表19提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是N，R^2是$N(Et)_2$，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0178] 表20

[0179] 表20提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是CH，R^2是$N(Et)_2$，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0180] 表21

[0181] 表21提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-F，R^2是$N(Et)_2$，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0182] 表22

[0183] 表22提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Br，R^2是$N(Et)_2$，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0184] 表23

[0185] 表23提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Cl，R^2是$N(Et)_2$，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0186] 表24

[0187] 表24提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-CF_3，R^2是$N(Et)_2$，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0188] 表25

[0189] 表25提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是N，R^2是iPr，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0190] 表26

[0191] 表26提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是CH，R^2是iPr，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0192] 表27

[0193] 表27提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-F，R^2是iPr，并且X_3、R^3、X_1、R^5是

如在表P中所定义的。

[0194] 表28

[0195] 表28提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Br，R^2是iPr，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0196] 表29

[0197] 表29提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Cl，R^2是iPr，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0198] 表30

[0199] 表30提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-CF_3，R^2是iPr，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0200] 表31

[0201] 表31提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是N，R^2是$N(Me)_2$，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0202] 表32

[0203] 表32提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是CH，R^2是$N(Me)_2$，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0204] 表33

[0205] 表33提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-F，R^2是$N(Me)_2$，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0206] 表34

[0207] 表34提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Br，R^2是$N(Me)_2$，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0208] 表35

[0209] 表35提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Cl，R^2是$N(Me)_2$，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0210] 表36

[0211] 表36提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-CF_3，R^2是$N(Me)_2$，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0212] 表37

[0213] 表37提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是N，R^2是cBu，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0214] 表38

[0215] 表38提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是CH，R^2是cBu，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0216] 表39

[0217] 表39提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-F，R^2是cBu，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0218] 表40

[0219] 表40提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Br，R^2是cBu，并且X_3、R^3、X_1、R^5

是如在表P中所定义的。

[0220] 表41

[0221] 表41提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Cl，R^2是cBu，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0222] 表42

[0223] 表42提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-CF_3，R^2是cBu，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0224] 表43

[0225] 表43提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是N，R^2是NHEt，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0226] 表44

[0227] 表44提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是CH，R^2是NHEt，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0228] 表45

[0229] 表45提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-F，R^2是NHEt，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0230] 表46

[0231] 表46提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Br，R^2是NHEt，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0232] 表47

[0233] 表47提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Cl，R^2是NHEt，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0234] 表48

[0235] 表48提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-CF_3，R^2是NHEt，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0236] 表49

[0237] 表49提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是N，R^2是CH_2CF_3，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0238] 表50

[0239] 表50提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是CH，R^2是CH_2CF_3，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0240] 表51

[0241] 表51提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-F，R^2是CH_2CF_3，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0242] 表52

[0243] 表52提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Br，R^2是CH_2CF_3，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0244] 表53

[0245] 表53提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Cl，R^2是CH_2CF_3，并且X_3、R^3、X_1、

R^5是如在表P中所定义的。

[0246] 表54

[0247] 表54提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-CF_3，R^2是CH_2CF_3，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0248] 表55

[0249] 表55提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是N，R^2是NHMe，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0250] 表56

[0251] 表56提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是CH，R^2是NHMe，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0252] 表57

[0253] 表57提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-F，R^2是NHMe，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0254] 表58

[0255] 表58提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Br，R^2是NHMe，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0256] 表59

[0257] 表59提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Cl，R^2是NHMe，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0258] 表60

[0259] 表60提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-CF_3，R^2是NHMe，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0260] 表61

[0261] 表61提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是N，R^2是NMeEt，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0262] 表62

[0263] 表62提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是CH，R^2是NMeEt，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0264] 表63

[0265] 表63提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-F，R^2是NMeEt，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0266] 表64

[0267] 表64提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Br，R^2是NMeEt，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0268] 表65

[0269] 表65提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Cl，R^2是NMeEt，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0270] 表66

[0271] 表66提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-CF_3，R^2是NMeEt，并且X_3、R^3、X_1、

R^5是如在表P中所定义的。

[0272] 表67

[0273] 表67提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是N，R^2是cPr，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0274] 表68

[0275] 表68提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是CH，R^2是cPr，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0276] 表69

[0277] 表69提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-F，R^2是cPr，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0278] 表70

[0279] 表70提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Br，R^2是cPr，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0280] 表71

[0281] 表71提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Cl，R^2是cPr，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0282] 表72

[0283] 表72提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-CF_3，R^2是cPr，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0284] 表73

[0285] 表73提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是N，R^2是CH_2Cl，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0286] 表74

[0287] 表74提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是CH，R^2是CH_2Cl，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0288] 表75

[0289] 表75提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-F，R^2是CH_2Cl，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0290] 表76

[0291] 表76提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Br，R^2是CH_2Cl，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0292] 表77

[0293] 表77提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Cl，R^2是CH_2Cl，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0294] 表78

[0295] 表78提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-CF_3，R^2是CH_2Cl，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0296] 表79

[0297] 表79提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是N，R^2是CH_2F，并且X_3、R^3、X_1、R^5是

如在表P中所定义的。

[0298] 表80

[0299] 表80提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是CH，R^2是CH_2F，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0300] 表81

[0301] 表81提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-F，R^2是CH_2F，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0302] 表82

[0303] 表82提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Br，R^2是CH_2F，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0304] 表83

[0305] 表83提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Cl，R^2是CH_2F，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0306] 表84

[0307] 表84提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-CF_3，R^2是CH_2F，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0308] 表85

[0309] 表85提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是N，R^2是CHF_2，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0310] 表86

[0311] 表86提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是CH，R^2是CHF_2，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0312] 表87

[0313] 表87提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-F，R^2是CHF_2，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0314] 表88

[0315] 表88提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Br，R^2是CHF_2，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0316] 表89

[0317] 表89提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Cl，R^2是CHF_2，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0318] 表90

[0319] 表90提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-CF_3，R^2是CHF_2，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0320] 表91

[0321] 表91提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是N，R^2是F，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0322] 表92

[0323] 表92提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是CH，R^2是F，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如

在表P中所定义的。

[0324] 表93

[0325] 表93提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-F，R^2是F，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0326] 表94

[0327] 表94提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Br，R^2是F，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0328] 表95

[0329] 表95提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-Cl，R^2是F，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0330] 表96

[0331] 表96提供了250种具有式(Ia)的化合物，其中X_2是C-CF_3，R^2是F，并且X_3、R^3、X_1、R^5是如在表P中所定义的。

[0332] 使得具有式(Int-I)的化合物可得的实例是那些，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，R^1是氢，n是2，A^1是CR^5，并且其中R^5和R^2各自对应于分别如上文式(Ia)背景中的表1至表96的每一个所定义的取代基R^5和R^2，因此例如，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，A2、A3和A4各自是CH，R^1是氢，n是2，A^1是CR^5，并且其中R^5和R^2各自是如在表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，R^1是氢，n是2，A^1是CR^5，并且其中R^5和R^2各自是如在表2中所定义的；表3至表96以此类推。

[0333] 使得具有式(Int-II)的化合物可得的实例是那些，其中X^c是CH_2Cl、CH_2Br、CH＝C(CF_3)(3-氯-5-三氟甲基-苯基)、CH＝C(CF_3)(3-溴-5-三氟甲基-苯基)、CH＝C(CF_3)(3,5-二氯-4-氟-苯基)、CH＝C(CF_3)(3,4,5-三氯-苯基)、CH_2C(OH)(CF_3)(3-氯-5-三氟甲基-苯基)、CH_2C(OH)(CF_3)(3-溴-5-三氟甲基-苯基)、CH_2C(OH)(CF_3)(3,5-二氯-4-氟-苯基)或CH_2C(OH)(CF_3)(3,4,5-三氯-苯基)，A2、A3和A4各自是CH，R^1是氢，n是2，A1是CR^5，并且其中R^5和R^2各自对应于分别如上文式(Ia)背景中的表1至表96的每一个所定义的取代基R^5和R^2，因此例如，表1个体化了具有式(Int-II)的化合物，其中X^c是CH_2Cl、CH_2Br、CH＝C(CF_3)(3-氯-5-三氟甲基-苯基)、CH＝C(CF_3)(3-溴-5-三氟甲基-苯基)、CH＝C(CF_3)(3,5-二氯-4-氟-苯基)、CH＝C(CF_3)(3,4,5-三氯-苯基)、CH_2C(OH)(CF_3)(3-氯-5-三氟甲基-苯基)、CH_2C(OH)(CF_3)(3-溴-5-三氟甲基-苯基)、CH_2C(OH)(CF_3)(3,5-二氯-4-氟-苯基)或CH_2C(OH)(CF_3)(3,4,5-三氯-苯基)，A2、A3和A4各自是CH，R^1是氢，n是2，A1是CR^5，并且其中R^5和R^2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^c是CH_2Cl、CH_2Br、CH＝C(CF_3)(3-氯-5-三氟甲基-苯基)、CH＝C(CF_3)(3-溴-5-三氟甲基-苯基)、CH＝C(CF_3)(3,5-二氯-4-氟-苯基)、CH＝C(CF_3)(3,4,5-三氯-苯基)、CH_2C(OH)(CF_3)(3-氯-5-三氟甲基-苯基)、CH_2C(OH)(CF_3)(3-溴-5-三氟甲基-苯基)、CH_2C(OH)(CF_3)(3,5-二氯-4-氟-苯基)或CH_2C(OH)(CF_3)(3,4,5-三氯-苯基)，A2、A3和A4各自是CH，R^1是氢，n是2，A1是CR^5，并且其中R^5和R^2各自是如在表2中所定义的；表3至表96以此类推。

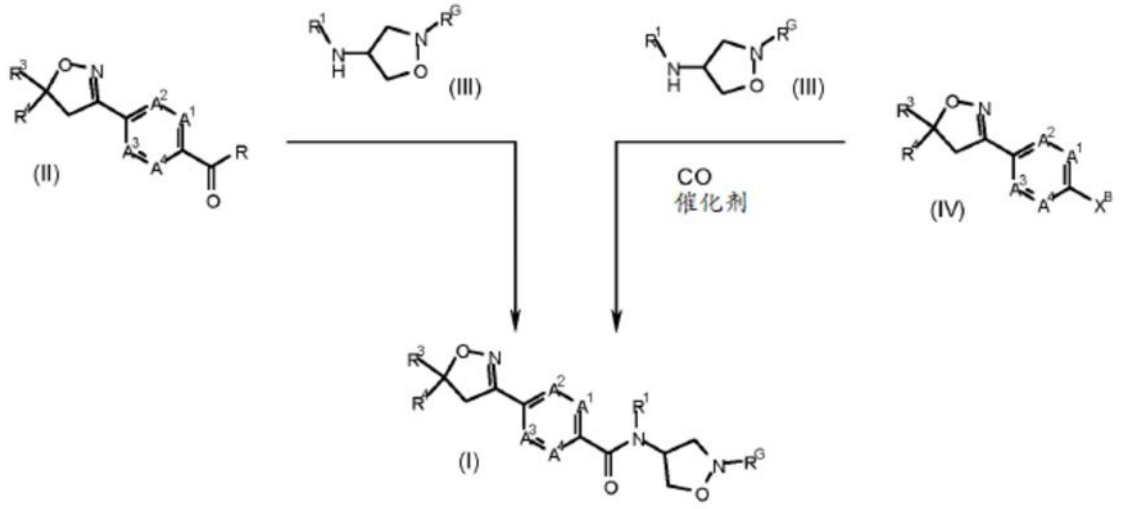
[0334] 使得具有式(Int-III)的化合物可得的实例是那些，其中R^1是氢，n是2，并且其中R^2

对应于如上文式(Ia)背景中的表1至表96的每一个所定义的取代基R^2,因此例如,表1个体化了具有式(Int-III)的化合物,其中R^1是氢,n是2,并且R^2是如在表1中所定义的。类似地,表2个体化了具有式(Int-III)的化合物,其中R^1是氢,n是2,并且其中R^2是如在表2中所定义的;表3至表96以此类推。

[0335] 本发明的这些化合物可以通过方案1和2中示出的多种方法来制备。

[0336] 方案1

[0337]



[0338] 1)如方案1中所示的,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_1-C_6烷氧基或Cl、F或Br)与具有式(III)的胺进行反应来制备,其中R^G是$S(O)_nR^2$或保护基团,诸如Boc。当R为OH时,此类反应通常是在偶联剂(诸如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)膦酰氯("BOP-Cl"))存在之下、在碱的存在下、以及可任选地在亲核性催化剂(诸如羟基苯并-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_1-C_6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℃至100℃、优选地从15℃至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。这些方法中的一些描述于制备实例中。

[0339] 2)具有式(II)的酸卤化物(其中R为Cl、F或Br)可在标准条件从具有式(II)的羧酸(其中R为OH)进行制备,例如在WO 2009080250中所述的。

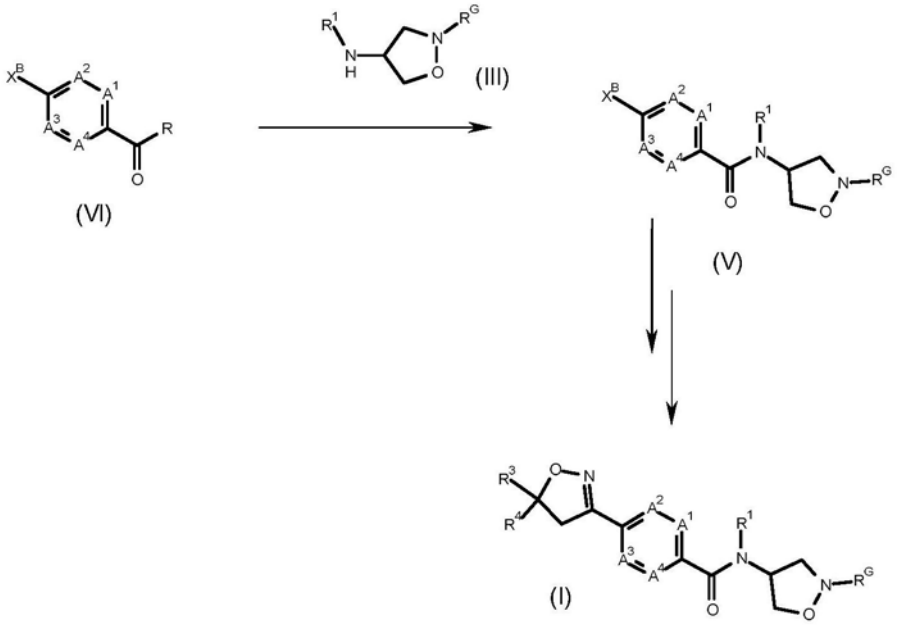
[0340] 3)具有式(II)的羧酸(其中R为OH)可从具有式(II)的酯(其中R为C_1-C_6烷氧基)进行制备,例如在WO 2009080250中所述的。

[0341] 4)在催化剂的存在下,例如钯乙酸(II)或双(三苯膦)钯(II)二氯化物,可任选地在配体的存在下,诸如三苯膦,以及碱,诸如碳酸钠、吡啶、三乙胺、4-(二甲氨基)-吡啶("DMAP")或二异丙基-乙胺(胡宁氏碱),在溶剂中,诸如水、N,N-二甲基甲酰胺或四氢呋喃,具有式(I)的化合物可以通过将具有式(IV)的化合物(其中X^B是离去基团,例如卤素(诸如

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。

[0342] 5)具有式(IV)的化合物(其中X^B是离去基团,例如卤素,诸如溴)可以通过各种方法来制造,例如在WO 2009080250中所描述的。

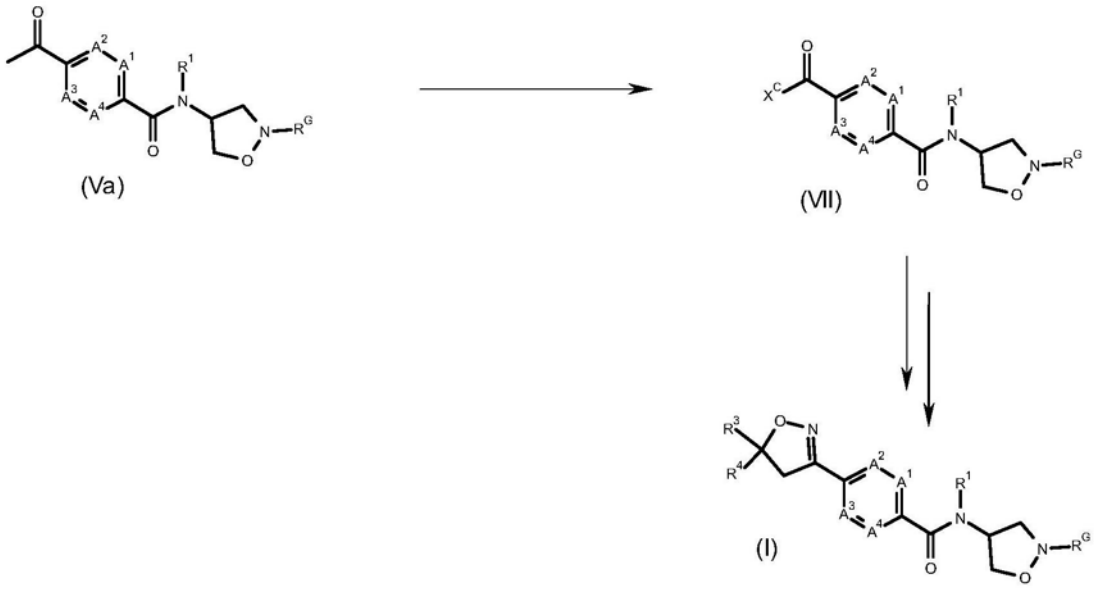
[0343] 方案2



[0344]

[0345] 6)可替代地,具有式(I)的化合物可以通过不同方法从方案2中所示的具有式(V)的中间产物(其中X^B是离去基团(例如卤素,诸如溴),或X^B是氰基、甲酰基、或乙酰基)根据类似于WO 2009080250中所述方法制备。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。

[0346] 方案3



[0347]

[0348] 7)可替代地,具有式(I)的化合物可以通过不同方法从方案3中所示的具有式(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))根据类似于WO 2009080250中所述方法制备。

[0349] 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)使用类似于WO 2009080250中所述的那些的方法制备。

[0350] 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℃至50℃,优选地从环境温度至40℃的温度下,在溶剂(诸如乙酸)中使具有式(Va)的甲基酮与卤化剂(例如溴或氯)反应来制备。

[0351] 10)具有式(III)的化合物是已知的化合物,或可以通过本领域普通技术人员已知的方法进行制备。这些方法的实例可以发现于下文实例中。

[0352] 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。这些可通过使用本发明化合物对抗并且控制的有害生物包括那些与农业(该术语包括食物和纤维产物的农作物的培育)、园艺和畜牧、宠物、林业和蔬菜源(诸如果实、谷粒和木材)的产物的储存有关的有害生物;那些与人造结构的损害及人和动物的疾病传播有关的有害生物;以及公害有害生物(诸如苍蝇)。根据本发明的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(诸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)发生破坏害虫;或间接显示,例如降低产卵和/或孵化率,对应于至少50%至60%的破坏率(死亡率)的良好活性。

[0353] 上述动物有害生物的实例是:

[0354] 来自蜱螨目,例如

[0355] 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(Calipitrimerus 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(Polyphagotarsone 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.);

[0356] 来自虱目(Anoplura),例如,

[0357] 血虱属(Haematopinus spp.)、长颚虱属(Linognathus spp.)、人虱(Pediculus spp.)、天疱疮属(Pemphigus spp.)以及木虱(Phylloxera spp.);

[0358] 来自鞘翅目(Coleoptera),例如,

[0359] 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(环cephala 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(Orycaephilus 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.)；

[0360] 来自双翅目(Diptera)，例如，

[0361] 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(Chrysomyia 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.)、瘿蚊属(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.)；

[0362] 来自半翅目(Hemiptera)，例如，

[0363] 瘤缘蝽(Acanthocoris scabrator)、绿蝽属(Acrosternum spp)、苜蓿盲蝽(Adelphocoris lineolatus)、Amblypelta nitida、海虾盾缘蝽(Bathycoelia thalassina)、土长蝽属(Blissus spp)、臭虫属(Cimex spp.)、Clavigralla tomentosicollis、盲蝽属(Creontiades spp.)、可可瘤盲蝽(Distantiella theobroma)、Dichelops furcatus、棉红蝽属(Dysdercus spp.)、Edessa属、美洲蝽属(Euchistus spp.)、六斑菜蝽(Eurydema pulchrum)、扁盾蝽属(Eurygaster spp.)、茶翅蝽(Halyomorpha halys)、具凹巨股长蝽(Horciasnobilellus)、稻缘蝽属(Lep-tocorisa spp.)、草盲蝽属(Lygus spp)、热带硕蚧属(Margarodes spp)、卷心菜斑色蝽(Murgantia histrionic)、Neomegalotomus属、烟盲蝽(Nesidiocoris tenuis)、绿蝽属(Nezara spp.)、拟长蝽(Nysius simulans)、海岛蝽象(Oebalus insularis)、皮蝽属(Piesma spp.)、壁蝽

属(Piezodorus spp)、红猎蝽属(Rhodnius spp.)、可可盲蝽象(Sahlbergella singularis)、栗土蝽(Scaptocoris castanea)、黑蝽属(Scotinophara spp.)、Thyanta属、锥鼻虫属(Triatoma spp.)、木薯网蝽(Vatiga illudens)；

[0364] 无网长管蚜属(Acyrthosium pisum)、Adalges属、Agalliana ensigera、塔尔吉隆脉木虱(Agonoscena targionii)、粉虱属(Aleurodicus spp.)、Aleurocanthus属、甘蔗穴粉虱(Aleurolobus barodensis)、软毛粉虱(Aleurothrixus floccosus)、甘蓝粉虱(Aleyrodes brassicae)、棉叶蝉(Amarasca biguttula)、檬果长突叶蝉(Amritodus atkinson)、肾圆盾蚧属(Aonidiella spp.)、蚜科(Aphididae)、蚜属(Aphis spp.)、蚧属(Aspidiotus spp.)、茄沟无网蚜(Aulacorthum solani)、马铃薯木虱(Bactericera cockerelli)、小粉虱属(Bemisia spp)、Brachycaudus属、甘蓝蚜(Brevicoryne brassicae)、喀木虱属(Cacopsylla spp)、双尾蚜(Cavariella aegopodii Scop.)、蜡蚧属(Ceroplaster spp.)、褐圆蚧(Chrysomphalus aonidium)、网籽草叶圆蚧(Chrysomphalus dictyospermi)、Cicadella属、大白叶蝉(Cofana spectra)、隐瘤蚜属(Cryptomyzus spp)、Cicadulina属、褐软蚧(Coccus hesperidum)、玉米黄翅叶蝉(Dalbulus maidis)、裸粉虱属(Dialeurodes spp)、柑橘木虱(Diaphorina citri)、麦双尾蚜(Diuraphis noxia)、西圆尾蚜属(Dysaphis spp)、小绿叶蝉属(Empoasca spp.)、苹果绵蚜(Eriosoma larigerum)、葡萄斑叶蝉属(Erythroneura spp.)、蜡蛤属(Gascardia spp.)、赤桉木虱(Glycaspis brimblecombei)、菜缢管蚜(Hyadaphis pseudobrassicae)、Hyalopterus属、超瘤蚜种(Hyperomyzus pallidus)、檬果绿叶蝉(Idioscopus clypealis)、非洲叶蝉(Jacobiasca lybica)、灰飞虱属(Laodelphax spp.)、球坚蚧(Lecanium corni)、蛎盾蚧属(Lepidosaphes spp.)、萝卜蚜(Lopaphis erysimi)、Lyogenys maidis、长管蚜属(Macrosiphum spp.)、沫蝉属(Mahanarva spp.)、蛾蜡蝉科(Metcalfa pruinosa)、麦无网蚜(Metopolophium dirhodum)、麦蜡蝉(Myndus crudus)、瘤蚜属(Myzus spp.)、台湾韭蚜(Neotoxoptera sp)、黑尾叶蝉属(Nephotettix spp.)、褐飞虱属(Nilaparvata spp.)、梨大绿蚜(Nippolachnus piri Mats)、狗牙根草芥壳虫(Odonaspis ruthae)、寄生甘蔗绵蚜(Oregma lanigera Zehnter)、杨梅缘粉虱(Parabemisia myricae)、考氏木虱(Paratrioza cockerelli)、片盾蚧属(Parlatoria spp.)、瘿绵蚜属(Pemphigus spp.)、玉米蜡蝉(Peregrinus maidis)、扁角飞虱属(Perkinsiella spp)、忽布疣蚜(Phorodon humuli)、根瘤蚜属(Phylloxera spp)、动性球菌属(Planococcus spp.)、白盾蚧属(Pseudaulacaspis spp.)、粉蚧属(Pseudococcus spp.)、棉盲蝽(Pseudatomoscelis seriatus)、木虱属(Psylla spp.)、棉蚧(Pulvinaria aethiopica)、笠圆盾蚧属(Quadraspidiotus spp.)、Quesada gigas、电光叶蝉(Recilia dorsalis)、缢管蚜属(Rhopalosiphum spp.)、黑盔蚧属(Saissetia spp.)、带叶蝉属(Scaphoideus spp.)、二叉蚜属(Schizaphis spp.)、麦蚜属(Sitobion spp.)、白背飞虱(Sogatella furcifera)、Spissistilus festinus、条斑飞虱(Tarophagus Proserpina)、声蚜属(Toxoptera spp)、粉虱属(Trialeurodes spp)、Tridiscus sporoboli、葵粉蚧属(Trionymus spp.)、非洲木虱(Trioza erytreae)、桔矢尖蚧(Unaspis citri)、Zygina flammigera、Zyginidia scutellaris；

[0365] 来自膜翅目(Hymenoptera)，例如，

[0366] 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.)；

[0367] 来自等翅目(Isoptera)，例如，

[0368] 家白蚁属(Coptotermes spp)、白蚁(Corniternes cumulans)、楹白蚁属(Incisitermes spp)、大白蚁属(Macrotermes spp)、澳白蚁属(Mastotermes spp)、小白蚁属(Microtermes spp)、散白蚁属(Reticulitermes spp.)；热带火蚁(Solenopsis geminate)

[0369] 来自鳞翅目(Lepidoptera)，例如，

[0370] 长翅卷蛾属(Acleris spp.)、褐带卷蛾属(Adoxophyes spp.)、透翅蛾属(Aegeria spp.)、地夜蛾属(Agrotis spp.)、棉叶虫(Alabama argillaceae)、Amylois属、黎豆夜蛾(Anticarsia gemmatalis)、黄卷蛾属(Archips spp.)、银蛾属(Argyresthia spp.)、带卷蛾属(Argyrotaenia spp.)、丫纹夜蛾属(Autographa spp.)、棉潜蛾(Bucculatrix thurberiella)、玉米楷夜蛾(Busseola fusca)、粉斑螟蛾(Cadra cautella)、桃蛀果蛾(Carposina nipponensis)、禾草螟属(Chilo spp.)、卷叶蛾属(Choristoneura spp.)、越蔓桔草螟(Chrysoteuchia topiaria)、葡萄果蠹蛾(Clysia ambiguella)、卷叶螟属(Cnaphalocrocis spp.)、云卷蛾属(Cnephasia spp.)、纹卷蛾属(Cochylis spp.)、鞘蛾属(Coleophora spp.)、磷翅目粉蝶(Colias lesbia)、Cosmophila flava、草螟属(Crambus spp)、大菜螟(Crocidolomia binotalis)、苹果异形小卷蛾(Cryptophlebia leucotreta)、黄杨木蛾(Cydalima perspectalis)、小卷蛾属(Cydia spp.)、黄杨绢野螟(Diaphania perspectalis)、杆草螟属(Diatraea spp.)、苏丹棉铃虫(Diparopsis castanea)、金刚钻属(Earias spp.)、非洲茎螟(Eldana saccharina)、粉螟属(Ephestia spp.)、叶小卷蛾属(Epinotia spp)、细斑灯蛾(Estigmene acrea)、Etiella zinckinella、花小卷蛾属(Eucosma spp.)、环针单纹蛾(Eupoecilia ambiguella)、黄毒蛾属(Euproctis spp.)、切根虫属(Euxoa spp.)、Feltia jaculiferia、Grapholita属、绿青虫蛾(Hedya nubiferana)、实夜蛾属(Heliothis spp.)、菜螟(Hellula undalis)、切叶野螟属(Herpetogramma spp)、美国白蛾(Hyphantria cunea)、番茄蠹蛾(Keiferia lycopersicella)、Lasmopalpus lignosellus、旋纹潜叶蛾(Leucoptera scitella)、潜叶细蛾属(Lithocollethis spp.)、葡萄花翅小卷蛾(Lobesia botrana)、Loxostege bifidalis、毒蛾属(Lymantria spp.)、潜蛾属(Lyonetia spp.)、幕枯叶蛾属(Malacosoma spp.)、甘蓝夜蛾(Mamestra brassicae)、烟草天蛾(Manduca sexta)、Mythimna属、夜蛾属(Noctua spp)、秋尺蛾属(Operophtera spp.)、Orniodes indica、欧洲玉米螟(Ostrinia nubilalis)、超小卷蛾属(Pammene spp.)、褐卷蛾属(Pandemis spp.)、小眼夜蛾(Panolis flammea)、蛀茎夜蛾(Papaipema nebris)、Pectinophora gossypi-ela、咖啡潜叶蛾(Perileucoptera coffeella)、一星黏虫(Pseudaletia unipuncta)、马铃薯麦蛾(Phthorimaea operculella)、菜粉蝶(Pieris rapae)、粉蝶属(Pieris spp.)、小菜蛾(Plutella xylostella)、芽蛾属(Prays spp.)、尺叶蛾属(Pseudoplusia spp)、薄荷灰夜蛾(Rachiplusia nu)、西方豆地香(Richia albicosta)、白禾螟属(Scirpophaga spp.)、蛀

茎夜蛾属(Sesamia spp.)、长须卷蛾属(Sparganothis spp.)、灰翅夜蛾属(Spodoptera spp.)、棉大卷叶螟(Sylepta derogate)、兴透翅蛾属(Synanthedon spp.)、异舟蛾属(Thaumetopoea spp.)、卷叶蛾属(Tortrix spp.)、粉纹夜蛾(Trichoplusia ni)、番茄斑潜蝇(Tuta absoluta)、以及巢蛾属(Yponomeuta spp.)

[0371] 来自食毛目(Mallophaga),例如,

[0372] 畜虱属(Damalinea spp.)和啮毛虱属(Trichodectes spp.);

[0373] 来自直翅目(Orthoptera),例如,

[0374] 蠊属(Blatta spp.)、小蠊属(Blattella spp.)、蝼蛄属(Gryllotalpa spp.)、马德拉蜚蠊(Leucophaea maderae)、飞蝗属(Locusta spp.)、北痣蟋蟀(Neocurtilla hexadactyla)、大蠊属(Periplaneta spp.)、痣蟋蟀属(Scapteriscus spp.)、以及沙漠蝗属(Schistocerca spp.);

[0375] 来自啮虫目(Psocoptera),例如,

[0376] 虱啮属(Liposcelis spp.);

[0377] 来自蚤目(Siphonaptera),例如,

[0378] 角叶蚤属(Ceratophyllus spp.)、栉头蚤属(Ctenocephalides spp.)以及开皇客蚤(Xenopsylla cheopis);

[0379] 来自缨翅目(Thysanoptera),例如,

[0380] Calliothrips phaseoli、花蓟马属(Frankliniella spp.)、阳蓟马属(Heliothrips spp)、褐带蓟马属(Hercinothrips spp.)、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(Taeniothrips spp.)、蓟马属(Thrips spp);

[0381] 来自缨尾目(Thysanura),例如,衣鱼(Lepisma saccharina)。

[0382] 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,诸如果实、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。

[0383] 适宜的目标作物具体是,谷物,诸如小麦、大麦、黑麦、燕麦、稻、玉米或高粱;甜菜,诸如糖用甜菜或饲料甜菜;水果,例如梨果、核果或无核小果,诸如苹果、梨、李子、桃、杏、樱桃或浆果,例如草莓、覆盆子或黑莓;豆科作物,诸如菜豆、小扁豆、豌豆或大豆;油料作物,诸如油菜、芥菜、罂粟、橄榄、向日葵、椰子、蓖麻、可可豆或落花生;瓜类作物,诸如南瓜、黄瓜或甜瓜;纤维植物,诸如棉花、亚麻、大麻或黄麻;柑橘类水果,诸如橙子、柠檬、葡萄柚或橘子;蔬菜,诸如菠菜、莴苣、芦笋、卷心菜、胡萝卜、洋葱、番茄、马铃薯或灯笼椒;樟科,诸如鳄梨、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。

[0384] 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。

[0385] 例如,本发明可用在任何以下观赏植物物种上:藿香蓟属(Ageratum spp.)、假面花属(Alonsoa spp.)、银莲花属(Anemone spp.)、南非葵(Anisodontea capsenisis)、春黄菊属(Anthemis spp.)、金鱼草属(Antirrhinum spp.)、紫菀属(Aster spp.)、秋海棠属

(Begonia spp.)(例如丽格海棠(B.elatior)、四季秋海棠(B.semperflorens)、球根秋海棠(B.tubéreux))、叶子花属(Bougainvillea spp.)、雁河菊属(Brachycome spp.)、芸苔属(Brassica spp.)(观赏植物)、蒲包草属(Calceolaria spp.)、辣椒(Capsicum annuum)、长春花(Catharanthus roseus)、美人蕉属(Canna spp.)、矢车菊属(Centaurea spp.)、菊属(Chrysanthemum spp.)、瓜叶菊属(Cineraria spp.)(银叶菊(C.maritime))、金鸡菊属(Coreopsis spp.)、青锁龙(Crassula coccinea)、火红萼距花(Cuphea ignea)、大丽花属(Dahlia spp.)、翠雀属(Delphinium spp.)、荷包牡丹(Dicentra spectabilis)、彩虹菊属(Dorotheantus spp.)、洋桔梗(Eustoma grandiflorum)、连翘属(Forsythia spp.)、倒挂金钟属(Fuchsia spp.)、鼠曲草老鹳草(Geranium gnaphalium)、大丁草属(Gerbera spp.)、千日红(Gomphrena globosa)、天芥菜属(Heliotropium spp.)、向日葵属(Helianthus spp.)、木槿属(Hibiscus spp.)、绣球花属(Hortensia spp.)、绣球属(Hydrangea spp.)、嫣红蔓(Hypoestes phyllostachya)、凤仙花属(Impatiens spp.)(非洲凤仙花(I.Walleriana))、血苋属(Iresines spp.)、伽蓝菜属(Kalanchoe spp.)、马缨丹(Lantana camara)、三月花葵(Lavatera trimestris)、狮耳花(Leonotis leonurus)、百合属(Lilium spp.)、日中花属(Mesembryanthemum spp.)、沟酸浆属(Mimulus spp.)、美国薄荷属(Monarda spp.)、龙面花属(Nemesia spp.)、万寿菊属(Tagetes spp.)、石竹属(Dianthus spp.)(康乃馨(carnation))、美人蕉属(Canna spp.)、酢浆草属(Oxalis spp.)、雏菊属(Bellis spp.)、天竺葵属(Pelargonium spp.)(盾叶天竺葵(P.peltatum)、马蹄纹天竺葵(P.Zonale))、堇菜属(Viola spp.)(三色堇(pansy))、碧冬茄属(Petunia spp.)、草夹竹桃属(Phlox spp.)、香茶菜属(Plecthranthus spp.)、一品红属(Poinsettia spp.)、爬山虎属(Parthenocissus spp.)(五叶爬山虎(P.quinquefolia)、爬山虎(P.tricuspidata))、报春花属(Primula spp.)、毛茛属(Ranunculus spp.)、杜鹃花属(Rhododendron spp.)、蔷薇属(Rosa spp.)(玫瑰(rose))、黄雏菊属(Rudbeckia spp.)、非洲堇属(Saintpaulia spp.)、鼠尾草属(Salvia spp.)、紫扇花(Scaevola aemola)、蛾蝶花(Schizanthus wisetonensis)、景天属(Sedum spp.)、茄属(Solanum spp.)、苏非尼亚矮牵牛属(Surfinia spp.)、万寿菊属(Tagetes spp.)、烟草属(Nicotinia spp.)、马鞭草属(Verbena spp.)、百日草属(Zinnia spp.)以及其他花坛植物。

[0386] 例如,本发明可用在任何以下蔬菜物种上:葱属(Allium spp.)(大蒜(A.sativum)、洋葱(A..cepa)、火葱(A.oschaninii)、韭葱(A.Porrum)、小葱(A.ascalonicum)、大葱(A.fistulosum))、有喙欧芹(Anthriscus cerefolium)、旱芹(Apium graveolus)、芦笋(Asparagus officinalis)、甜菜(Beta vulgarus)、芸苔属(甘蓝(B.Oleracea)、大白菜(B.Pekinensis)、芜菁(B.rapa))、辣椒、鹰嘴豆(Cicer arietinum)、苦苣(Cichorium endivia)、菊苣属(Cichorum spp.)(菊苣(C.intybus)、苦苣(C.endivia))、西瓜(Citrillus lanatus)、香瓜属(Cucumis spp.)(黄瓜(C.sativus)、甜瓜(C.melo))、南瓜属(Cucurbita spp.)(西葫芦(C.pepo)、印度南瓜(C.maxima))、菜蓟属(Cyanara spp.)(朝鲜蓟(C.scolymus)、刺苞菜蓟(C.cardunculus))、胡萝卜(Daucus carota)、茴香(Foeniculum vulgare)、金丝桃属(Hypericum spp.)、莴苣(Lactuca sativa)、番茄属(Lycopersicon spp.)(番茄(L.esculentum)、樱桃番茄(L.lycopersicum))、薄荷属(Mentha spp.)、罗勒(Ocimum basilicum)、香芹

(Petroselinum crispum)、菜豆属(Phaseolus spp.)(菜豆(P.vulgaris)、荷包豆(P.coccineus))、豌豆(Pisum sativum)、萝卜(Raphanus sativus)、食用大黄(Rheum rhaponticum)、迷迭香属(Rosemarinus spp.)、鼠尾草属(Salvia spp.)、黑婆罗门参(Scorzonera hispanica)、茄子(Solanum melongena)、菠菜(Spinacea oleracea)、新缬草属(Valerianella spp.)(蒿苣缬草(V.locusta)、绵毛果小缬草(V.Eriocarpa))以及蚕豆(Vicia faba)。

[0387] 优选的观赏植物物种包括非洲堇(African violet)、秋海棠属、大丽花属、大丁草属、绣球属、马鞭草属、蔷薇属、伽蓝菜属、一品红属、紫菀属、矢车菊属、金鸡菊属、翠雀属、美国薄荷属、草夹竹桃属、黄雏菊属、景天属、碧冬茄属、堇菜属、凤仙花属、老鹳草属、菊属、毛茛属、倒挂金钟属、鼠尾草属、绣球花属、迷迭香、鼠尾草、圣约翰草(St.Johnswort)、薄荷(mint)、甜椒(sweet pepper)、番茄和黄瓜(cucumber)。

[0388] 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(Aphis craccivora)、黄瓜条叶甲(Diabrotica balteata)、烟芽夜蛾(Heliothis virescens)、桃蚜(Myzus persicae)、小菜蛾(Plutella xylostella)以及海灰翅夜蛾(Spodoptera littoralis)。根据本发明所述的活性成分另外尤其适合于控制甘蓝夜蛾(Mamestra)(优选地在蔬菜上)、苹果蠹蛾(Cydia pomonella)(优选地在苹果上)、小绿叶蝉(Empoasca)(优选地在蔬菜、葡萄园里)、马铃薯叶甲(Leptinotarsa)(优选地在马铃薯上)以及二化螟(Chilo supressalis)(优选地在水稻上)。

[0389] 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。根据本发明所述的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)。

[0390] 在另一个方面中,本发明还可涉及一种控制由植物寄生线虫(内寄生的-、半内寄生的-和外寄生线虫)对植物及其部分的损害的方法,尤其是以下植物寄生线虫,诸如根结线虫(root knot nematodes)、北方根结线虫(Meloidogyne hapla)、南方根结线虫(Meloidogyne incognita)、爪哇根结线虫(Meloidogyne javanica)、花生根结线虫(Meloidogyne arenaria)以及其他根结线虫物种;孢囊形成线虫(cyst-forming nematodes)、马铃薯金线虫(Globodera rostochiensis)以及其他球孢囊线虫属(Globodera)物种;禾谷孢囊线虫(Heterodera avenae)、大豆孢囊线虫(Heterodera glycines)、甜菜孢囊线虫(Heterodera schachtii)、红三叶异皮线虫(Heterodera trifolii)、以及其他异皮线虫属(Heterodera)物种;种瘿线虫(Seed gall nematodes)、粒线虫属(Anguina)物种;茎及叶面线虫(Stem and foliar nematodes)、滑刃线虫属(Aphelenchoides)物种;刺毛线虫(Sting nematodes)、长尾刺线虫(Belonolaimus longicaudatus)以及其他刺线虫属(Belonolaimus)物种;松树线虫(Pine nematodes)、松材线虫(Bursaphelenchus xylophilus)以及其他伞滑刃属(Bursaphelenchus)物种;环形线虫(Ring nematodes)、环线虫属(Criconema)物种、小环线虫属(Criconemella)物种、轮线虫属(Criconemoides)物种、中环线虫属(Mesocriconema)物种;茎及鳞球茎线虫(Stem and bulb nematodes)、(腐烂茎线虫(Ditylenchus destructor)、鳞球茎茎线虫

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

[0391] 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,螺科(Ampullariidae);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(Bradybaenidae)(灌木巴蜗牛(Bradybaena fruticum));蜗牛属(Cepaea)(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)、庭园灰括蝓(D.reticulatum));Discus(圆盘螺属)(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(Helicidae)Helicigona arbustorum);Helicodiscus;大蜗牛属(Helix)(开放大蜗牛(H.Aperta));蛞蝓属(Limax)(灰黑赔蝓(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(温室蛞蝓)(M.gagates、M.marginatus、M.Sowerbyi);钻螺属(Opeas);瓶螺属(Pomacea)(小管福寿螺(P.canaticulata));瓦娄蜗牛属(Vallonia)和仿带螺属(Zanitoides)。

[0392] 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(诸如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®、Herculex I®和LibertyLink®商标名下是可商购的。

[0393] 作物还应被理解为天然地是或已经赋予对害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,这些毒素诸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δ-内毒素,营养期杀虫蛋白(Vip),细菌定殖线虫的杀虫蛋白,以及由蝎子、蛛形纲动物、黄蜂和真菌产生的毒素。

[0394] 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®(先正达种子公司(Syngenta Seeds))。包括编码杀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®(先正达种子公司)。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虫蛋白同时耐受除草剂的能力,例如Herculex I®(陶氏益农公司(Dow AgroSciences),先锋良种国际公司(Pioneer Hi-Bred International))。

[0395] 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,诸如木材、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。

[0396] 本发明还提供了用于控制害虫(诸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/)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(诸如墙、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,诸如无纺或织物材料,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)。

[0397] 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(诸如墙、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,该基底是诸如处于网织品、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。

[0398] 有待处理的基质(包括无纺物、织物或网织品)可以由天然纤维,诸如棉花、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,诸如聚酰胺、聚酯、聚丙烯、聚丙烯腈等等制成。聚酯是特别适合的。织物处理的方法是已知的,例如WO2008151984、WO2003034823、US5631072、WO2005064072、WO2006128870、EP1724392、WO2005113886或WO2007090739。

[0399] 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。

[0400] 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X和Y中列出的钻木虫：

[0401] 表X.具有经济重要性的外来钻木虫的实例。

[0402]

科	种	受侵染的宿主或作物
吉丁虫科（Buprestidae）	*白蜡窄吉丁*	白蜡木
天牛科（Cerambycidae）	*光肩天牛（Anoplura glabripennis）*	硬木（Hardwoods）
小蠹科（Scolytidae）	*粗穗赖草足距小蠹（Xylosandrus crassiusculus）*	硬木（Hardwoods）
	削尾材小蠹（X. mutilatus）	硬木
	纵坑切梢小蠹（*Tomicus piniperda*）	松柏类植物

[0403] 表Y.具有经济重要性的本地钻木虫的实例。

[0404]

科	种	受侵染的宿主或作物
吉丁虫科（Buprestidae）	桦铜窄吉丁（*Agrilus anxius*）	桦树
	磨光窄吉丁（*Agrilus politus*）	柳树、枫树
	Agrilus sayi	杨梅、香蕨木
	Agrilus vittaticolllis	苹果树、梨树、蔓越橘、唐棣、山楂树
	苹扁头吉丁（Chrysobothris femorata）	苹果树、杏树、山毛榉、白蜡槭、樱桃树、栗树、红醋栗树、榆树、山楂树、朴树、山核桃树、欧洲七叶树、菩提树、枫树、欧洲花楸树、橡

[0405]

科	种	受侵染的宿主或作物
		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
	Texania campestris	椴木、山毛榉、枫树、橡树、美国梧桐、柳树、黄杨
天牛科（Cerambycidae）	*对山毛榉天牛（Goes pulverulentus）*	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（Goes tigrinus）	橡树
	黑腹尼虎天牛（Neoclytus acuminatus）	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（Neoptychodes trilineatus）	无花果树、赤杨木、桑树、柳树、网叶朴树（Netleaf hackberry）
	灰翅筒天牛（Oberea ocellata）	漆树、苹果树、桃树、李子树、梨树、红醋栗树、黑莓
	三点筒天牛属（Oberea tripunctata）	山茱萸、英蒾属、榆树、酸模树、蓝莓、杜鹃花属、杜鹃、月桂树、杨树、柳树、桑树
	绕枝沟胫天牛（*Oncideres cingulata*）	山核桃树、美洲山核桃树、柿子树、榆树、酸模树、菩提树、美国皂荚木、山茱萸、桉树、橡树、朴树、枫树、果树
	对杨黄斑楔天牛（*Saperda calcarata*）	杨树

[0406]

科	种	受侵染的宿主或作物
	Strophiona nitens	栗树、橡树、山核桃树、核桃树、山毛榉、枫树
小蠹科（Scolytidae）	*Corthylus columbianus*	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（*Dendroctonus frontalis*）	松树
	美桦毛小蠹（*Dryocoetes betulae*）	桦树、枫香、野樱桃树、山毛榉、梨树
	黄带芳小蠹（*Monarthrum fasciatum*）	橡树、枫树、桦树、栗树、枫香、蓝果木、杨树、山核桃树、含羞草、苹果树、桃树、松树
	桃鳃角小蠹（*Phloeotribus liminaris*）	桃树、樱桃树、李子树、黑樱桃树、榆树、桑树、欧洲花楸树
	Pseudopityophthorus pruinosus	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（Sesiidae）	栎透翅蛾（*Paranthrene simulans*）	橡树、美洲栗树
	Sannina uroceriformis	柿子树
	小桃翅蛾（*Synanthedon exitiosa*）	桃树、李子树、油桃树、樱桃树、杏树、扁桃树、黑樱桃树
	李桃翅蛾（*Synanthedon pictipes*）	桃树、李子树、樱桃树、山毛榉、黑樱桃树
	Synanthedon rubrofascia	蓝果树
	Synanthedon scitula	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、英蒾属、柳树、苹果树、枇杷树、九层皮、杨梅
	葡萄根透翅蛾(*Vitacea polistiformis*)	葡萄树

[0407] 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、蝼蛄、介壳虫、粉蚧蜱、沫蝉、南方麦小蜡以及蜚蠊。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。

[0408] 具体而言,本发明可用于控制用草坪草的根部喂养的昆虫有害生物,该昆虫有害生物包括蛴螬(诸如圆头犀金龟属(Cyclocephala spp.)(例如标记的金龟子、C.lurida)、Rhizotrogus属(例如欧洲金龟子,欧洲切根鳃金龟

[0409] (R.majalis))、黄栌属(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(硕蚡属(Margarodes spp.))、蝼蛄(褐黄色的、南方的、以及短翅的;痣蟋蟀属(Scapteriscus spp.)、非洲蝼蛄(Gryllotalpa africana))以及大蚊幼虫(leatherjackets)(欧洲大蚊(European crane fly)、大蚊属(Tipula spp.))。

[0410] 本发明还可以用于控制茅草住宅的草坪草的昆虫有害生物,这些昆虫有害生物包括粘虫(诸如秋夜蛾(fall armyworm)草地贪夜蛾(Spodoptera frugiperda),和常见夜蛾一星黏虫(Pseudaletia unipuncta))、切根虫,象鼻虫(尖隐喙象属(Sphenophorus spp.),诸如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)。

[0411] 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蜡(诸如南方麦小蜡,南方杆长蜡(Blissus insularis))、狗牙根螨(Bermudagrass mite)(Eriophyes cynodoniensis)、盖氏虎尾草粉蚧(草竹粉蚧(Antonina graminis))、两线沫蝉(Propsapia bicincta)、叶蝉、切根虫(夜蛾科)、以及麦二叉蚜。

[0412] 本发明还可以用于控制草坪草中的其他有害生物,诸如在草坪中创建蚁巢的外引红火蚁(红火蚁(Solenopsis invicta))。

[0413] 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诸如硬蜱、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。

[0414] 此类寄生虫的实例是:

[0415] 虱目(Anoplurida):血虱属、长颚虱属、人虱属和阴虱属(Phtirus spp.)、盲虱属(Solenopotes spp.)。

[0416] 食毛目(Mallophagida):毛羽虱属(Trimenopon spp.)、短角鸟虱属(Menopon spp.)、鸭虱属(Trinoton spp.)、牛羽虱属(Bovicola spp.)、Werneckiella属、Lepikentron属、畜虱属(Damalina spp.)、啮毛虱属以及猫羽虱属(Felicola spp.)。

[0417] 双翅目及长角亚目(Nematocerina)和短角亚目(Brachycerina),例如伊蚊属、疟蚊属、库蚊属、蚋属(Simulium spp.)、真蚋属(Eusimulium spp.)、白蛉属(Phlebotomus spp.)、罗蛉属(Lutzomyia spp.)、库蠓属(Culicoides spp.)、斑虻属(Chrysops spp.)、驼背虻属(Hybomitra spp.)、黄虻属(Atylotus spp.)、虻属、麻虻属(Haematopota spp.)、Philipomyia属、蜂虱蝇属(Braula spp.)、家蝇属、齿股蝇属(Hydrotaea spp.)、螯蝇属、黑角蝇属(Haematobia spp.)、莫蝇属(Morellia spp.)、厕蝇属、舌蝇属、丽蝇属(Calliphora spp.)、绿蝇属、金蝇属、污蝇属(Wohlfahrtia spp.)、麻蝇属(Sarcophaga spp.)、狂蝇属、皮蝇属、胃蝇属(Gasterophilus spp.)、虱蝇属(Hippobosca spp.)、羊虱蝇属(Lipoptena

spp.)和蜱蝇属(Melophagus spp.)。

[0418] 蚤目(Siphonapterida),例如蚤属(Pulex spp.)、栉头蚤属、客蚤属(Xenopsylla spp.)、角叶蚤属。

[0419] 异翅目(Heteropterida),例如臭虫属、锥鼻虫属属、红猎蝽属、锥蝽属(Panstrongylus spp.)。

[0420] 蜚蠊目(Blattarida),例如东方蜚蠊(Blatta orientalis)、美洲大蠊(Periplaneta americana)、德国小蠊(Blattelagermanica)以及夏柏拉蟑螂属(Supella spp.)。

[0421] 蜱螨(Acaria)亚纲(螨科(Acarida))和后气门目(Meta-stigmata)和中气门目(Meso-stigmata),例如锐缘蜱属、钝缘蜱属(Ornithodorus spp.)、耳蜱属(Otobius spp.)、硬蜱属、钝眼蜱属、牛蜱属(Boophilus spp.)、革蜱属(Dermacentor spp.)、血蜱属(Haemophysalis spp.)、璃眼蜱属、扇头蜱属、皮刺螨属(Dermanyssus spp.)、刺利螨属(Raillietia spp.)、肺刺螨属(Pneumonyssus spp.)、胸刺螨属(Sternostoma spp.)和瓦螨属(Varroa spp.)。

[0422] 轴螨目(Actinedida)(前气门亚目(Prostigmata))和粉螨目(Acaridida)(无气门亚目(Astigmata)),例如蜂盾螨属(Acarapis spp.)、姬螯属(Cheyletiella spp.)、禽螯螨属(Ornithocheyletia spp.)、肉螨属(Myobia spp.)、疮螨属(Psorergates spp.)、蠕形螨属(Demodex spp.)、恙螨属(Trombicula spp.)、牦螨属(Listrophorus spp.)、粉螨属(Acarus spp.)、食酪螨属(Tyrophagus spp.)、嗜木螨属(Caloglyphus spp.)、颈下螨属(Hypodectes spp.)、翅螨属(Pterolichus spp.)、痒螨属、皮螨属、耳疥螨属(Otodectes spp.)、疥螨属、耳螨属(Notoedres spp.)、鸟疥螨属(Knemidocoptes spp.)、胞螨属(Cytodites spp.)以及鸡雏螨属(Laminosioptes spp.)。

[0423] 根据本发明的组合物还适用于保护材料诸如木材、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。

[0424] 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,诸如欧洲木白蚁、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。

[0425] 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(诸如载体、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、可乳化的浓缩剂、微可乳化浓缩剂、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、水可溶性浓缩剂(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在使用前稀释。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。

[0426] 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(诸如精细分散固体、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。

[0427] 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。微胶囊通常具有从0.1至500微米的直径。它们含有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。包囊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。

[0428] 适合于制备根据本发明所述的这些组合物的配制品佐剂本身是已知的。作为液体载体可使用: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、二甲基亚砜、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、α-蒎烯、d-苧烯、乳酸乙酯、乙二醇、乙二醇丁基醚、乙二醇甲基醚、γ-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,诸如戊醇、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。

[0429] 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。

[0430] 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,诸如十二烷基硫酸二乙醇铵;烷基芳基磺酸酯的盐,诸如十二烷基苯磺酸钙;烷基酚/氧化烯加成产物,诸如乙氧基化壬基苯酚;醇/氧化烯加成产物,诸如乙氧基化十三烷醇;皂,诸如硬脂酸钠;烷基萘磺酸酯的盐,诸如二丁基萘磺酸钠;磺基丁二酸二烷基酯的盐,诸如二(2-乙基己基)磺基丁二酸钠;山梨糖醇酯,诸如山梨糖醇油酸酯;季铵,诸

如氯化十二烷基三甲基铵;脂肪酸的聚乙二醇酯,诸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)。

[0431] 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。

[0432] 根据本发明所述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从0.01%至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,诸如鱼油或牛脂。优选的油添加剂包括C_8-C_{22}脂肪酸的烷基酯,尤其是C_{12}-C_{18}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,10th Edition,Southern Illinois University,2010[除草剂佐剂纲要,第10版,南伊利诺伊大学,2010]。

[0433] 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%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剂,最终使用者将通常使用稀释配制品。

[0434] 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1l/ha至2000l/ha,尤其是从10l/ha到1000l/ha的比率施用。

[0435] 优选的配制品可以具有以下成分(重量%):

[0436] 可乳化的浓缩物:

[0437] 活性成分: 1%至95%,优选60%至90%

[0438] 表面活性剂: 1%至30%,优选5%至20%

[0439] 液体载体: 1%至80%,优选1%至35%

[0440] 尘剂(dust):

[0441] 活性成分: 0.1%至10%,优选0.1%至5%

[0442] 固体载体: 99.9%至90%,优选99.9%至99%

[0443] 悬浮液浓缩剂:

[0444] 活性成分: 5%至75%,优选10%至50%

[0445] 水: 94%至24%,优选88%至30%

[0446] 表面活性剂: 1%至40%,优选2%至30%

[0447] 可湿性粉剂:

[0448] 活性成分: 0.5%至90%,优选1%至80%

[0449] 表面活性剂： 0.5%至20%，优选1%至15%

[0450] 固体载体： 5%至95%，优选15%至90%

[0451] 颗粒剂：

[0452] 活性成分： 0.1%至30%，优选0.1%至15%

[0453] 固体载体： 99.5%至70%，优选97%至85%

[0454] 以下实例进一步阐述了(但不限制)本发明：

[0455]

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

[0456] 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。

[0457]

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

[0458] 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。

[0459]

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

[0460] 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。

[0461]

尘剂	a)	b)	c)
活性成分	5%	6%	4%
滑石	95%	-	-
高岭土	-	94%	-
矿物填充剂	-	-	96%

[0462] 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。

[0463]

挤出机颗粒剂	

[0464]

活性成分	15%
木质素磺酸钠	2%
羧甲基纤维素	1)
高岭土	82%

[0465] 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。将混合物挤出并且然后在空气流中干燥。

[0466]

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

[0467] 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。

[0468] 悬浮液浓缩剂

[0469]

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%

[0470] 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。

[0471] 种子处理用的可流动性浓缩物

[0472]

活性成分	40 %

[0473]

丙二醇	5%
共聚物丁醇PO/EO	2%
三苯乙烯酚，具有10-20摩尔EO	2%
1,2-苯并异噻唑啉-3-酮（呈在水中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%

[0474] 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。

[0475] 缓释的胶囊悬浮剂

[0476] 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。向此乳液中加入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加入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。

[0477] 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。

[0478] 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。

[0479] 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。

[0480] 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至表96和表P中的化合物组成”)：

[0481] 佐剂，该佐剂选自由以下物质组成的组：石油(别名)(628)+TX，

[0482] 杀螨剂，该杀螨剂选自由以下物质组成的组：1,1-二(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-氯苯基苯基砜(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、涕灭砜威(863)+TX、α-氯氰菊酯(202)+TX、赛硫磷(870)+TX、磺胺螨酯[CCN]+TX、氨基硫代盐(872)+TX、胺吸磷(875)+TX、胺吸磷草酸氢盐(875)+TX、双甲脒(24)+TX、杀螨特(881)+TX、三氧化二砷(882)+TX、AVI382(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、苯茵灵(62)+TX、苯诺沙磷(benoxafos)(替代名称)[CCN]+TX、苯螨特(benzoximate)(71)+TX、苯甲酸苄酯(IUPAC名称)[CCN]+TX、联苯肼酯(74)+TX、氟氯菊酯(76)+TX、乐杀螨(907)+TX、溴灭菊酯(替代名称)+TX、溴烯杀(bromocyclene)

(918)+TX、溴硫磷(920)+TX、乙基溴硫磷(921)+TX、溴螨酯(bromopropylate)(94)+TX、噻嗪酮(99)+TX、丁酮威(103)+TX、丁酮砜威(104)+TX、丁酮威(butylpyridaben)(替代名称)+TX、石硫合剂(calciumpolysulfide)(IUPAC名称)(111)+TX、毒杀芬(campheechlor)(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、CGA50'439(研究代码)(125)+TX、灭螨猛(chinomethionat)(126)+TX、杀螨醚(chlorbenside)(959)+TX、杀虫脒(964)+TX、杀虫脒盐酸盐(964)+TX、溴虫腈(130)+TX、敌螨(968)+TX、杀螨酯(chlorfenson)(970)+TX、敌螨特(chlorfensulphide)(971)+TX、氯芬磷(131)+TX、乙酯杀螨醇(chlorobenzilate)(975)+TX、伊托明(chloromebuform)(977)+TX、灭虫脲(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、瓜叶菊素(cinerins)(696)+TX、四螨嗪(158)+TX、氯氰碘柳胺(替代名称)[CCN]+TX、库马磷(174)+TX、克罗米通(替代名称)[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(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-methylsulphon)(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)(替代名称)+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)(替代名称)(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、二硝酯(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、二苯砜(IUPAC名称)(1103)+TX、双硫仑(替代名称)[CCN]+TX、乙拌磷(278)+TX、DNOC(282)+TX、苯氧炔螨(dofenapyn)(1113)+TX、多拉克汀(替代名称)[CCN]+TX、硫丹(294)+TX、因毒磷(endothion)(1121)+TX、EPN(297)+TX、依立诺克丁(替代名称)[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、喹螨醚(328)+TX、苯丁锡(fenbutatinoxide)(330)+TX、苯硫威(fenothiocarb)(337)+TX、甲氰菊酯(342)+TX、吡螨胺(fenpyrad)(替代名称)+TX、唑螨酯(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、嘧螨酯(fluacrypyrim)(360)+TX、氟佐隆(1166)+TX、氟螨噻(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、FMC1137(研究代码)(1185)+TX、抗螨脒(405)+TX、抗螨脒盐酸盐(405)+TX、安硫磷(formothion)(1192)+TX、胺甲威(formparanate)(1193)+TX、γ-HCH(430)+TX、果绿啶(glyodin)(1205)+TX、苄螨醚(halfenprox)(424)+TX、庚烯醚(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)(替代名称)(473)+TX、异丙基0-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸酯(IUPAC名称)(473)+TX、伊维菌素(替代名称)[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、苄丙二腈(malonoben)(1254)+TX、灭蚜磷(mecarbam)(502)+TX、地胺磷(mephosfolan)(1261)+TX、甲硫芬(替代名称)[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、米尔螨素(557)+TX、杀螨茵素肟(milbemycinoxime)(替代名称)[CCN]+TX、丙胺氟磷(mipafox)(1293)+TX、久效磷(561)+TX、茂硫磷(morphothion)(1300)+TX、莫昔克丁(替代名称)[CCN]+TX、二溴磷(567)+TX、NC-184(化合物代码)+TX、NC-512(化合物代码)+TX、氟蚁灵(1309)+TX、尼柯霉素(替代名称)[CCN]+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、氧乐果(594)+TX、杀线威(602)+TX、异亚砜磷(1324)+TX、砜拌磷(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、对硫磷(615)+TX、氯菊酯(626)+TX、石油(替代名称)(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)(替代名称)(653)+TX、丙氯诺(1350)+TX、丙溴磷(662)+TX、蜱虱威(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、嘧螨醚(pyrimidifen)(706)+TX、嘧硫磷(1370)+TX、喹硫磷(quinalphos)(711)+TX、喹硫磷(quintiofos)(1381)+TX、R-1492(研究代码)(1382)+TX、RA-17(研究代码)(1383)+TX、鱼藤酮(722)+TX、八甲磷(schr+dan)(1389)+TX、硫线磷(sebufos)(替代名称)+TX、塞拉菌素(selamectin)(替代名称)[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(研究代码)(1404)+TX、舒非仑(替代名称)[CCN]+TX、氟虫胺(sulfluramid)(750)+TX、治螟磷(sulfotep)(753)+TX、硫黄(754)+TX、SZI-121(研究代码)(757)+TX、氟胺氰菊酯(398)+TX、吡螨胺(763)+TX、TEPP(1417)+TX、叔丁威(terbam)(替代名称)+TX、替罗磷(777)+TX、三氯杀螨砜(tetradifon)(786)+TX、杀螨霉素(tetranactin)(替代名称)(653)+TX、杀螨硫醚(tetrasul)(1425)+TX、久效威(thiafenox)(替代名称)+TX、抗虫威(thiocarboxime)(1431)+TX、久效威(thiofanox)(800)+TX、甲基乙拌磷(thiometon)(801)+TX、克杀螨(1436)+TX、苏力菌素(thuringiensin)(替代名称)[CCN]+TX、威茵磷(triamiphos)(1441)+TX、苯噻螨(triarathene)(1443)+TX、三唑磷(820)+TX、唑呀威(triazuron)(替代名称)+TX、敌百虫(824)+TX、氯苯乙丙磷(trifenofos)(1455)+TX、甲杀螨霉素(trinactin)(替代名称)(653)+TX、灭蚜硫磷(847)+TX、氟吡唑虫(vaniliprole)[CCN]和YI-5302(化合物代码)+TX，

[0483] 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、二氢萘醌(dichlone)(1052)+TX、双氯酚(232)+TX、茵多酸(295)+TX、三苯锡(fentin)(347)+TX、熟石灰[CCN]+TX、代森钠(nabam)(566)+TX、灭藻醌(quinoclamine)(714)+TX、醌萍胺(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，

[0484] 驱螨虫剂，该驱螨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(替代名称)[CCN]+TX、依马克丁(291)+TX、依马克丁苯甲酸酯(291)+TX、依立诺克丁(替代名称)[CCN]+TX、伊维菌素(替代名称)[CCN]+TX、米尔倍霉素(替代名称)[CCN]+TX、莫昔克丁(替代名称)[CCN]+TX、哌嗪[CCN]+TX、塞拉菌素(selamectin)(替代名称)[CCN]+TX、多杀菌素(737)和硫菌灵(thiophanate)(1435)+TX，

[0485] 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，

[0486] 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-(喹喔啉-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(替代名称)[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(替代名称)[CCN]+TX，

[0487] 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)(替代名称)(12)+TX、放射形土壤杆菌(替代名称)(13)+TX、捕食螨(替代名称)(19)+TX、芹菜夜蛾核多角体病毒(Anagrapha falcifera NPV)(替代名称)(28)+TX、Anagrus atomus(替代名称)(29)+TX、蚜虫寄生蜂(替代名称)(33)+TX、棉蚜寄生蜂(替代名称)(34)+TX、食蚜瘿蚊(替代名称)(35)+TX、苜蓿银纹夜蛾核多角体病毒(Autographa californica NPV)(替代名称)(38)+TX、坚强芽孢杆菌(替代名称)(48)+TX、球形芽孢杆菌(学名)(49)+TX、苏云金杆菌(Bacillus thuringiensis Berliner)(学名)(51)+TX、苏云金杆菌鲇泽亚种(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(替代名称)(53)+TX、布氏白僵菌(替代名称)(54)+TX、草蜻蛉(替代名称)(151)+TX、孟氏隐唇瓢虫(替代名称)(178)+TX、苹果蠹蛾颗粒体病毒(Cydia pomonella GV)(替代名称)(191)+TX、西伯利亚离颚茧蜂(替代名称)(212)+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂(替代名称)(254)+TX、丽蚜小蜂(学名)(293)+TX、桨角蚜小蜂(替代名称)(300)+TX、玉米穗夜蛾核多角体病毒(Helicoverpa zea NPV)(替代名称)(431)+TX、嗜茵异小杆线虫和H.megidis(替代名称)(433)+TX、会聚长足瓢虫(Hippodamia convergens)(替代名称)(442)+TX、橘粉介壳虫寄生蜂(Leptomastix

dactylopii)(替代名称)(488)+TX、盲蝽(Macrolophus caliginosus)(替代名称)(491)+TX、甘蓝夜蛾核多角体病毒(Mamestra brassicae NPV)(替代名称)(494)+TX、Metaphycus helvolus(替代名称)(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(替代名称)(575)+TX、小花蝽(替代名称)(596)+TX、玫烟色拟青霉(替代名称)(613)+TX、智利捕植螨(替代名称)(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(替代名称)(742)+TX、小卷蛾斯氏线虫(替代名称)(742)+TX、夜蛾斯氏线虫(替代名称)(742)+TX、Steinernema glaseri(替代名称)(742)+TX、Steinernema riobrave(替代名称)(742)+TX、Steinernema riobravis(替代名称)(742)+TX、Steinernema scapterisci(替代名称)(742)+TX、斯氏线虫属(替代名称)(742)+TX、赤眼蜂属(替代名称)(826)+TX、西方盲走螨(替代名称)(844)和蜡蚧轮枝菌(替代名称)(848)+TX，

[0488] 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，

[0489] 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)(替代名称)[CCN]+TX、白消安(替代名称)[CCN]+TX、除虫脲(250)+TX、迪麦夫(dimatif)(替代名称)[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(methylapholate)[CCN]+TX、不孕啶(morzid)[CCN]+TX、氟幼脲(penfluron)(替代名称)[CCN]+TX、涕巴(tepa)[CCN]+TX、硫代六甲磷(thiohempa)(替代名称)[CCN]+TX、硫涕巴(替代名称)[CCN]+TX、曲他胺(替代名称)[CCN]和尿烷亚胺(替代名称)[CCN]+TX，

[0490] 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、A-摩的斯曲里汀(multistriatin)(替代名称)[CCN]+TX、西部松小蠹集合信息素(brevicomin)(替代名称)[CCN]+TX、十二碳二烯醇(codlelure)(替代名称)[CCN]+TX、十二碳二烯醇(codlemone)(替代名称)(167)+TX、诱蝇酮(cuelure)(替代名称)(179)+TX、环氧十九烷(disparlure)(277)+TX、十二碳-8-烯-1基乙酸酯(IUPAC名称)(286)+TX、十二碳-9-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(287)+TX、十二碳-8+TX、10-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(284)+TX、dominicalure(替代名称)[CCN]+TX、4-甲基辛酸乙酯(IUPAC名

称)(317)+TX、丁香酚(替代名称)[CCN]+TX、南部松小蠹集合信息素(frontalin)(替代名称)[CCN]+TX、诱虫十六酯(gossyplure)(替代名称)(420)+TX、诱杀烯混剂(grandlure)(421)+TX、诱杀烯混剂I(替代名称)(421)+TX、诱杀烯混剂II(替代名称)(421)+TX、诱杀烯混剂III(替代名称)(421)+TX、诱杀烯混剂IV(替代名称)(421)+TX、醋酸十六烯酯(hexalure)[CCN]+TX、齿小蠹二烯醇(ipsdienol)(替代名称)[CCN]+TX、小蠹烯醇(ipsenol)(替代名称)[CCN]+TX、金龟子性诱剂(japonilure)(替代名称)(481)+TX、lineatin(替代名称)[CCN]+TX、litlure(替代名称)[CCN]+TX、粉纹夜蛾性诱剂(looplure)(替代名称)[CCN]+TX、诱杀酯(medlure)[CCN]+TX、megatomoicacid(替代名称)[CCN]+TX、诱虫醚(methyl eugenol)(替代名称)(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)(替代名称)[CCN]+TX、oryctalure(替代名称)(317)+TX、非乐康(ostramone)(替代名称)[CCN]+TX、诱虫环(siglure)[CCN]+TX、sordidin(替代名称)(736)+TX、食菌甲诱醇(sulcatol)(替代名称)[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(别岩)(839)+TX、特诱酮B1(替代名称)(839)+TX、特诱酮B2(替代名称)(839)+TX、特诱酮C(替代名称)(839)和trunc-call(替代名称)[CCN]+TX，

[0491] 昆虫驱避剂，该昆虫驱避剂选自以下物质组成的组：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、避蚊胺[CCN]+TX、驱蚊酯(dimethyl carbate)[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，

[0492] 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、啶虫脒(4)+TX、家蝇磷(替代名称)[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、涕灭砜威(863)+TX、氯甲桥萘(864)+TX、烯丙菊酯(17)+TX、阿洛氨菌素(替代名称)[CCN]+TX、除害威(866)+TX、α-氯氰

菊酯(202)+TX、α-蜕皮激素(替代名称)[CCN]+TX、磷化铝(640)+TX、赛硫磷(870)+TX、硫代酰胺(872)+TX、灭害威(873)+TX、胺吸磷(875)+TX、胺吸磷草酸氢盐(875)+TX、双甲脒(24)+TX、新烟碱(877)+TX、乙基杀扑磷(883)+TX、AVI382(化合物代码)+TX、AZ60541(化合物代码)+TX、印楝素(替代名称)(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δ内毒素类(替代名称)(52)+TX、六氟硅酸钡(替代名称)[CCN]+TX、多硫化钡(IUPAC/化学文摘名称)(892)+TX、熏菊酯[CCN]+TX、Bayer22/190(研究代码)(893)+TX、Bayer22408(研究代码)(894)+TX、噁虫威(58)+TX、丙硫克百威(60)+TX、杀虫磺(66)+TX、β氟氯氰菊酯(194)+TX、β-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(替代名称)(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、双三氟虫脲(83)+TX、硼砂(86)+TX、溴灭菊酯(替代名称)+TX、溴苯烯磷(914)+TX、溴杀烯(918)+TX、溴-DDT(替代名称)[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、脱甲基丁嘧啶磷(butathiofos)(927)+TX、丁酮威(103)+TX、丁酯膦(932)+TX、丁酮砜威(104)+TX、丁基哒螨灵(替代名称)+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、丁硫克百成(119)+TX、杀螟丹(123)+TX、杀螟丹盐酸盐(123)+TX、西伐丁(替代名称)(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)(替代名称)+TX、顺式苄呋菊酯(cismethrin)(80)+TX、功夫菊酯(替代名称)+TX、除线威(999)+TX、氯氰碘柳胺(替代名称)[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(替代名称)[CCN]+TX、巴毒磷(1010)+TX、克芦磷酯(1011)+TX、冰晶石(替代名称)(177)+TX、CS708(研究代码)(1012)+TX、苯腈膦(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、畜蜱磷(替代名称)[CCN]+TX、d-柠檬烯(替代名称)[CCN]+TX、d-四甲菊酯(替代名称)(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-O(1037)+TX、田乐磷-S(1037)+TX、内吸磷(1038)+TX、内吸磷-甲基(224)+TX、内吸磷-O(1038)+TX、内吸磷-O-甲基(224)+TX、内吸磷-S(1038)+TX、内吸磷-S-甲基(224)+TX、内吸磷-S-甲基砜(1039)+TX、丁醚脲(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)(替代名称)+TX、迪克莱赛尔(dicresyl)(替代名称)[CCN]+TX、百治磷(243)+TX、地昔尼尔(244)+TX、狄氏刑(1070)+TX、二乙基5-甲基吡唑-3-基磷酸酯(IUPAC名称)(1076)+TX、除虫脲(250)+TX、二羟丙茶碱(dilor)(替代名称)[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(替代名称)[CCN]+TX、DSP(1115)+TX、蜕皮激素(替代名称)[CCN]+TX、EI1642(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(替代名称)[CCN]+TX、高氰戊菊酯(302)+TX、牛津郡丙硫磷(etaphos)(替代名称)[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(替代名称)(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、嘧酰虫胺(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)(替代名称)+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、伏康脲(flucofuron)(1168)+TX、氟环脲(366)+TX、氟氰戊菊酯(367)+TX、联氟螨(1169)+TX、嘧虫胺[CCN]+TX、氟虫脲(370)+TX、三氟醚菊酯(1171)+TX、氟氯苯菊酯(372)+TX、氟胺氰菊酯(1184)+TX、FMC1137(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、γ-氯氟氰菊酯(197)+TX、γ-HCH(430)+TX、双胍盐(422)+TX、双胍醋酸盐(422)+TX、GY-81(研究代码)(423)+TX、苄螨醚(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、氟铃脲(439)+TX、HHDN(864)+TX、氟蚁腙(443)+TX、氢氰酸(444)+TX、烯虫乙酯(445)+TX、海驱威(hyquincarb)(1223)+TX、吡虫啉(458)+TX、炔咪菊酯(460)+TX、茚虫威(465)+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、IPSP(1229)+TX、氯唑磷(1231)+TX、碳氯灵(1232)+TX、水胺硫磷(替代名称)(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(替代名称)[CCN]+TX、茉酮菊素I(696)+TX、茉酮菊素II(696)+TX、碘硫磷(1248)+TX、保幼激素I(替代名称)[CCN]+TX、保幼激素II(替代名称)[CCN]+TX、保幼激素III(替代名称)[CCN]+TX、氯戊环(1249)+TX、烯虫炔酯(484)+TX、λ-氯氟氰菊酯(198)+TX、砷酸铅[CCN]+TX、雷皮菌素(CCN)+TX、对溴磷(1250)+TX、林旦(430)+TX、丙嘧硫磷(lirimfos)(1251)+TX、虱螨脲(490)+TX、噻唑磷(1253)+TX、间异丙基苯基甲基氨基甲酸酯(IUPAC名称)(1014)+TX、磷化镁(IUPAC名称)(640)+TX、马拉硫磷(492)+TX、特螨腈(1254)+TX、叠氮磷(1255)+TX、灭蚜磷(502)+TX、四甲磷(1258)+TX、灭蚜硫磷(1260)+TX、地安磷(1261)+TX、氯化亚汞(513)+TX、线虫灵(mesulfenfos)(1263)+TX、氰氟虫腙(CCN)+TX、威百亩(519)+TX、威百亩钾(替代名

称)(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、甲喹丁(1276)+TX、甲醚菊酯(替代名称)(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(替代名称)[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(替代名称)[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(替代名称)[CCN]+TX、萘酞磷(替代名称)[CCN]+TX、二溴磷(567)+TX、萘(IUPAC/化学文摘名称)(1303)+TX、Nc-170(研究代码)(1306)+TX、NC-184(化合物代码)+TX、烟碱(578)+TX、硫酸烟碱(578)+TX、氟蚁灵(1309)+TX、烯啶虫胺(579)+TX、硝乙脲噻唑(nithiazine)(1311)+TX、戊氰威(1313)+TX、戊氰威1:1氯化锌络合物(1313)+TX、NNI-0101(化合物代码)+TX、NNI-0250(化合物代码)+TX、降烟碱(传统名称)(1319)+TX、双苯氟脲(585)+TX、多氟脲(586)+TX、O-5-二氯-4-碘苯基O-乙基乙基硫代膦酸酯(IUPAC名称)(1057)+TX、O,O-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,O-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,O,O',O'-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、砜吸磷-甲基(609)+TX、异亚砜磷(1324)+TX、砜拌磷(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、对-二氯苯[CCN]+TX、对硫磷(615)+TX、对硫磷-甲基(616)+TX、氟幼脲(替代名称)[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(替代名称)(628)+TX、PH60-38(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、虫螨磷-乙基(1345)+TX、虫螨磷-甲基(652)+TX、聚氯二环戊二烯异构体类(IUPAC名称)(1346)+TX、聚氯萜类(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(替代名称)[CCN]+TX、早熟素II(替代名称)[CCN]+TX、早熟素III(替代名称)[CCN]+TX、乙酰嘧啶磷(primidophos)(1349)+TX、丙溴磷(662)+TX、丙氟菊酯[CCN]+TX、蜱虱威(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、丙苯烃菊酯(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、啶虫丙醚(700)+TX、哒嗪硫磷(701)+TX、嘧螨醚(706)+TX、嘧硫磷(1370)+TX、吡丙醚(708)+TX、苦木提取物(quassia)(替代名称)[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(替代名称)[CCN]+TX、苄呋菊酯(719)+TX、鱼藤酮(722)+TX、RU15525(研究代码)(723)+TX、RU25475(研究代码)(1386)+TX、尼亚那(ryania)(替代名称)(1387)+TX、利阿诺定(传统名称)(1387)+TX、沙巴藜芦(替代名称)(725)+TX、八甲磷(1389)+TX、硫线磷(替代名称)+TX、塞拉菌素(替代名称)[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、SN72129(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(替代名称)(758)+TX、τ-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)(替代名称)+TX、特丁硫磷(773)+TX、四氯乙烷[CCN]+TX、杀虫畏(777)+TX、四甲菊酯(787)+TX、θ氯氰菊酯(204)+TX、噻虫啉(791)+TX、塞芬诺克斯(thiafenox)(替代名称)+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(替代名称)[CCN]+TX、唑虫酰胺(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(替代名称)+TX、敌百虫(824)+TX、三氯偏磷酸-3(trichlormetaphos-3)(替代名称)[CCN]+TX、毒壤膦(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(替代名称)(725)+TX、藜芦碱(替代名称)(725)+TX、XMC(853)+TX、灭杀威(854)+TX、YI-5302(化合物代码)+TX、ζ-氯氰菊酯(205)+TX、泽塔米林(zetamethrin)(替代名称)+TX、磷化锌(640)+TX、丙硫恶唑磷(zolaprofos)(1469)以及ZXI8901(研究代码)(858)+TX、氰虫酰胺[736994-63-19]+TX、氯虫酰胺[500008-45-7]+TX、唑螨氰(cyenopyrafen)[560121-52-0]+TX、丁氟螨酯[400882-07-7]+TX、氟虫吡喹(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、砜虫啶(sulfoxaflor)[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WO 2012/092115中)+TX、fluxametamide(WO 2007/026965)+TX、ε-美特宁(epsilon-metofluthrin)[240494-71-7]+TX、ε-momfluorothrin[1065124-65-3]+TX、氟炔丙菊酯(fluazaindolizine)[1254304-22-7]+TX、氯炔丙菊酯(chloroprallethrin)[399572-87-3]+TX、fluxametamide[928783-29-3]+TX、氯氟氰虫酰胺(cyhalodiamide)[1262605-53-7]+TX、tioxazafen[330459-31-9]+TX、双酰胺杀虫剂(broflanilide)[1207727-04-5]+TX、丁烯氟虫腈[704886-18-0]+TX、环溴虫酰胺[1031756-98-5]+TX、氟氰虫酰胺(tetraniliprole)[1229654-66-3]+TX、戊吡虫胍(描述于WO2010/060231中)+TX、环氧虫啶(描述于WO2005/077934中)+TX，

[0493] 杀软体动物剂，该杀软体动物剂选自由以下物质组成的组：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、五氯苯酚(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，

[0494] 杀线虫剂，该杀线虫剂选自由以下物质组成的组：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(替代名称)(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、涕灭砜威(aldoxycarb)(863)+TX、AZ 60541(化合物代码)+TX、benclothiaz[CCN]+TX、苯茵灵(62)+TX、丁基哒螨酮(butylpyridaben)(替代名称)+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)(替代名称)(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)(替代名称)+TX、乐果(262)+TX、多拉克汀(替代名称)[CCN]+TX、依马克丁(291)+TX、依马克丁苯甲酸酯(291)+TX、依立诺克丁(替代名称)[CCN]+TX、灭线磷(312)+TX、二溴乙烷(316)+TX、苯线磷(fenamiphos)(326)+TX、吡螨胺(替代名称)+TX、丰索磷(fenpyrad)(1158)+TX、噻唑磷(fosthiazate)(408)+TX、丁硫环磷(fosthietan)(1196)+TX、糠醛(替代名称)[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(替代名称)[CCN]+TX、激动素(替代名称)(210)+TX、甲基灭蚜磷(mecarphon)(1258)+TX、威百亩(519)+TX、威百亩钾盐(替代名称)(519)+TX、威百亩钠盐(519)+TX、甲基溴(537)+TX、异硫氰酸甲酯(543)+TX、杀螨菌素肟(milbemycinoxime)(替代名称)[CCN]+TX、莫昔克丁(替代名称)[CCN]+TX、疣孢漆斑菌(Myrotheciumverrucaria)组分(替代名称)(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)(替代名称)+TX、塞拉菌素(selamectin)(替代名称)[CCN]+TX、多杀菌素(737)+TX、叔丁威(terbam)(替代名称)+TX、特丁磷(terbufos)(773)+TX、四氯噻吩(IUPAC/化学文摘名)(1422)+TX、噻菲农(替代名称)+TX、虫线磷(thionazin)(1434)+TX、三唑磷(triazophos)(820)+TX、triazuron(替代名称)+TX、二甲苯酚[CCN]+TX、YI-5302(化合物代码)和玉米素(替代名称)(210)+TX、fluensulfone[318290-98-1]+TX，

[0495] 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]以及氯啶(nitrapyrin)(580)+TX，

[0496] 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(Reynoutriasachalinensis)提取物(替代名称)(720)+TX，

[0497] 杀鼠剂，该杀鼠剂选自由以下物质组成的组：2-异戊酰茚满-1,3-二酮(IUPAC名称)(1246)+TX、4-(喹喔啉-2-基氨基)苯磺酰胺(IUPAC名称)(748)+TX、α-氯代醇[CCN]+TX、

磷化铝(640)+TX、安妥(880)+TX、三氧化二砷(882)+TX、碳酸钡(891)+TX、双鼠脲(912)+TX、溴鼠隆(89)+TX、溴敌隆(91)+TX、溴鼠胺(92)+TX、氰化钙(444)+TX、氮醛糖(127)+TX、氯鼠酮(140)+TX、维生素D3(替代名称)(850)+TX、氯灭鼠灵(1004)+TX、克灭鼠(1005)+TX、杀鼠萘(175)+TX、杀鼠嘧啶(1009)+TX、鼠得克(246)+TX、噻鼠灵(249)+TX、敌鼠钠(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、γ-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、士的宁(745)+TX、硫酸铊[CCN]+TX、杀鼠灵(851)以及磷化锌(640)+TX，

[0498] 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(替代名称)(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)和亚砜(1406)+TX，

[0499] 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、吡啶-4-胺(IUPAC名称)(23)+TX、塞仑(804)+TX、混杀威(trimethacarb)(840)+TX、环烷酸锌[CCN]和福美锌(856)+TX，

[0500] 杀病毒剂，该杀病毒剂选自由以下物质组成的组：衣马宁(替代名称)[CCN]和利巴韦林(替代名称)[CCN]+TX，

[0501] 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)和甲基硫茵灵(802)+TX，

[0502] 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、氟喹唑[136426-54-5]+TX、氟硅唑[85509-19-9]+TX、粉唑醇[76674-21-0]+TX、己唑醇[79983-71-4]+TX、抑霉唑[35554-44-0]+TX、亚胺唑[86598-92-7]+TX、种菌唑[125225-28-7]+TX、叶菌唑[125116-23-6]+TX、腈菌唑[88671-89-0]+TX、稻瘟酯[101903-30-4]+TX、戊菌唑[66246-88-6]+TX、丙硫菌唑[178928-70-6]+TX、啶斑肟(pyrifenox)[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、苯锈啶(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(chlozolinate)[84332-86-5]+TX、菌核利(dichlozoline)[24201-58-9]+TX、异菌脲(Iprodione)[36734-19-7]+TX、myclozoline[54864-61-8]+TX、腐霉利(procymidone)[32809-16-8]+TX、乙烯菌核利(vinclozoline)[50471-44-8]+TX、啶酰菌胺(boscalid)[188425-85-6]+TX、萎锈灵[5234-68-4]+TX、甲呋酰苯胺[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、啶氧菌酯[117428-22-5]+TX、唑菌胺酯[175013-18-0]+TX、福美铁[14484-64-1]+TX、代森锰锌[8018-01-7]+TX、代森锰[12427-38-2]+TX、代森联[9006-42-2]+TX、甲代森锌(propineb)[12071-83-9]+TX、塞仑[137-26-8]+TX、代森锌[12122-67-7]+TX、福美锌[137-30-4]+TX、敌菌丹(captafol)[2425-06-1]+TX、克菌丹[133-06-2]+TX、苯氟磺胺[1085-98-9]+TX、唑啶草(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、嘧菌腙(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、碘喹唑酮(proquinazid)[189278-12-4]+TX、乐喹酮(pyroquilon)[57369-32-1]+TX、喹氧灵[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、嗪氨灵[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-羧酸(9-二氯亚甲基-1,2,3,4-四氢-1,4-桥亚甲基-萘-5-基)-酰胺(披露于WO 2007/048556中)+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸(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、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;Lancotrione[1486617-21-3]+TX;氯氟吡啶酯(florpyrauxifen)[943832-81-3]+TX;ipfentrifluconazole[1417782-08-1]+TX;氯氟醚菌唑(mefentrifluconazole)[1417782-03-6]+TX;Quinofumelin[861647-84-9]+TX;右旋反式氯丙炔菊酯(chloroprallethrin)[399572-87-3]+TX;氯氟氰虫酰胺(cyhalodiamide)[1262605-53-7]+TX;三氟咪啶酰胺(fluazaindolizine)[1254304-22-7]+TX;fluxametamide[928783-29-3]+TX;ε-美特宁[240494-71-7]+TX;ε-momfluorothrin[1065124-65-3]+TX;pydiflumetofen[1228284-64-7]+TX;κ-联苯菊酯[439680-76-9]+TX;双酰胺杀虫剂[1207727-04-5]+TX;dicloromezotiaz[1263629-39-5]+TX;dipymetitrone[16114-35-5]+TX;pyraziflumid[942515-63-1]+TX;和κ-七氟菊酯[391634-71-2]+TX;以及

[0503] 微生物剂,包括:鲁氏不动杆菌(Acinetobacter lwoffii)+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(Adoxophyes orana granulovirus)(AdoxGV)(Capex®)+TX、放射形土壤杆菌(Agrobacterium radiobacter)菌株K84(Galltrol-A®)+TX、互隔链格孢(Alternaria alternate)+TX、决明链格孢(Alternaria cassia)+TX、损毁链格孢(Alternaria destruens)+TX、白粉寄生孢(Ampelomyces quisqualis)(AQ10®)+TX、黄曲霉AF36(Aspergillus flavus AF36)(AF36®)+TX、黄曲霉NRRL 21882(Aspergillus flavus NRRL 21882)(Aflaguard®)+TX、曲霉属(Aspergillus spp.)+TX、出芽短梗霉

(Aureobasidium pullulans)+TX、固氮螺菌属(Azospirillum)+TX、(MicroAZ®+TX、TAZO B®)+TX、固氮菌属(Azotobacter)+TX、圆褐固氮菌(Azotobacter chroocuccum)(Azotomeal®)+TX、孢囊固氮菌(Azotobacter cysts)(Bionatural Blooming Blossoms®)+TX、解淀粉芽孢杆菌(Bacillus amyloliquefaciens)+TX、蜡样芽孢杆菌(Bacillus cereus)+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(Bacillus licheniformis)菌株HB-2(Biostart™ Rhizoboost®)+TX、地衣芽孢杆菌菌株3086(EcoGuard®+TX、Green Releaf®)+TX、环状芽孢杆菌(Bacillus circulans)+TX、坚硬芽孢杆菌(BioSafe®+TX、BioNem-WP®+TX、VOTiVO®)+TX、坚硬芽孢杆菌菌株I-1582+TX、浸麻芽孢杆菌(Bacillus macerans)+TX、Bacillus marismortui+TX、巨大芽孢杆菌(Bacillus megaterium)+TX、蕈状芽孢杆菌(Bacillus mycoides)菌株AQ726+TX、日本甲虫芽孢杆菌(Bacillus papillae)(Milky Spore Powder®)+TX、短小芽孢杆菌属(Bacillus pumilus spp.)+TX、短小芽孢杆菌(Bacillus pumilus)菌株GB34(Yield Shield®)+TX、短小芽孢杆菌(Bacillus pumilus)菌株AQ717+TX、短小芽孢杆菌菌株QST 2808(Sonata®+TX、Ballad Plus®)+TX、球形芽孢杆菌(Bacillus spahericus)+TX、芽孢杆菌属(Bacillus spp.)+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(Bacillus subtilis)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(Bacillus subtilis var.amyloliquefaciens)菌株FZB24(Taegro®+TX、Rhizopro®)+TX、苏云金芽孢杆菌(Bacillus thuringiensis)Cry 2Ae+TX、苏云金芽孢杆菌Cry1Ab+TX、苏云金芽孢杆菌鲇泽亚种(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+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、苏云金芽孢杆菌鲇泽变种(Bacillus thuringiensis var.aizawai)(XenTari®+TX、DiPel®)+TX、细菌属(bacteria spp.)(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(Beauveria bassiana)(Beaugenic®+TX、Brocaril WP®)+TX、球孢白僵菌GHA(Mycotrol ES®+TX、Mycotrol O®+TX、BotaniGuard®)+TX、布氏白僵菌(Beauveria brongniartii)(

Engerlingspilz®+TX、Schweizer Beauveria®+TX、Melocont®)+TX、白僵菌属(Beauveria spp.)+TX、灰葡萄孢霉(Botrytis cineria)+TX、大豆慢生型根瘤菌(Bradyrhizobium japonicum)(TerraMax®)+TX、短短小芽孢杆菌(Brevibacillus brevis)+TX、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种(Bacillus thuringiensis tenebrionis)(Novodor®)+TX、BtBooster+TX、洋葱伯克霍尔德菌(Burkholderia cepacia)(Deny®+TX、Intercept®+TX、Blue Circle®)+TX、伯克霍尔德菌(Burkholderia gladii)+TX、唐菖蒲伯克霍尔德菌(Burkholderia gladioli)+TX、伯克霍尔德菌属(Burkholderia spp.)+TX、加拿大蓟真菌(Canadian thistle fungus)(CBH Canadian Bioherbicide®)+TX、奶酪假丝酵母(Candida butyri)+TX、无名假丝酵母(Candida famata)+TX、Candida fructus+TX、光滑念珠菌(Candida glabrata)+TX、吉利蒙念珠菌(Candida guilliermondii)+TX、口津假丝酵母(Candida melibiosica)+TX、橄榄假丝酵母(Candida oleophila)菌株O+TX、近平滑假丝酵母(Candida parapsilosis)+TX、菌膜假丝酵母(Candida pelliculosa)+TX、铁红假丝酵母(Candida pulcherrima)+TX、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(Candida sake)+TX、假丝酵母属(Candida spp.)+TX、纤细假丝酵母(Candida tenius)+TX、戴氏西地西菌(Cedecea dravisae)+TX、产黄纤维单胞菌(Cellulomonas flavigena)+TX、螺卷毛壳(Chaetomium cochliodes)(Nova-Cide®)+TX、球毛壳菌(Chaetomium globosum)(Nova-Cide®)+TX、铁杉紫色杆菌(Chromobacterium subtsugae)菌株PRAA4-1T(Grandevo®)+TX、枝状枝孢菌(Cladosporium cladosporioides)+TX、尖孢枝孢(Cladosporium oxysporum)+TX、Cladosporium chlorocephalum+TX、枝孢属(Cladosporium spp.)+TX、极细枝孢霉(Cladosporium tenuissimum)+TX、粉红粘帚霉(Clonostachys rosea)(EndoFine®)+TX、尖孢炭疽菌(Colletotrichum acutatum)+TX、盾壳霉(Coniothyrium minitans)(Cotans WG®)+TX、盾壳霉属(Coniothyrium spp.)+TX、浅白隐球酵母(Cryptococcus albidus)+TX、土生隐球菌(Cryptococcus humicola)+TX、Cryptococcus infirmo-miniatus+TX、罗伦隐球酵母(Cryptococcus laurentii)+TX、苹果异形小卷蛾颗粒体病毒(Cryptophlebia leucotreta granulovirus)(Cryptex®)+TX、坎平贪铜菌(Cupriavidus campinensis)+TX、苹果蠹蛾颗粒体病毒(Cydia pomonella granulovirus)(CYD-X®)+TX、苹果蠹蛾颗粒体病毒(Madex®+TX、Madex Plus®+TX、Madex Max/ Carpovirusine®)+TX、Cylindrobasidium laeve+TX、枝双孢霉属(Cylindrocladium)+TX、汉逊德巴利酵母(Debaryomyces hansenii)+TX、Drechslera hawaiinensis+TX、阴沟肠杆菌(Enterobacter cloacae)+TX、肠杆菌科(Enterobacteriaceae)+TX、毒力虫霉(Entomophtora virulenta)(Vektor®)+TX、黑附球菌(Epicoccum nigrum)+TX、黑附球菌(Epicoccum purpurascens)+TX、附球菌属(Epicoccum spp.)+TX、花状线黑粉菌(Filobasidium floriforme)+TX、锐顶镰孢菌(Fusarium acuminatum)+TX、厚垣镰孢霉(Fusarium chlamydosporum)+TX、尖镰孢

(Fusarium oxysporum)(Fusaclean® / Biofox C®)+TX、层生镰孢(Fusarium proliferatum)+TX、镰孢属(Fusarium spp.)+TX、溶磷白地霉(Galactomyces geotrichum)+TX、链孢粘帚霉(Gliocladium catenulatum)(Primastop®+TX、Prestop®)+TX、粉红粘帚霉(Gliocladium roseum)+TX、粘帚霉属(Gliocladium spp.)+TX、绿色粘帚霉(Gliocladium virens)(Soilgard®)+TX、颗粒体病毒属(Granulovirus)(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(Halomonas spp.)+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(Hanseniaspora uvarum)+TX、棉铃虫核型多角体病毒(Helicoverpa armigera nucleopolyhedrovirus)(Helicovex®)+TX、玉米穗虫核型多角体病毒(Helicoverpa zea nuclear polyhedrosis virus)(Gemstar®)+TX、异黄酮-芒柄花黄素(Isoflavone-formononetin)(Myconate®)+TX、柠檬克勒克酵母(Kloeckera apiculata)+TX、克勒克酵母属(Kloeckera spp.)+TX、大链壶菌(Lagenidium giganteum)+TX、长孢蜡蚧菌(Lecanicillium longisporum)+TX、蜡蚧轮枝菌(Lecanicillium muscarium)+TX、舞毒蛾核多角体病毒(Lymantria Dispar nucleopolyhedrosis virus)(Disparvirus®)+TX、嗜盐海球菌(Marinococcus halophilus)+TX、格氏梅拉菌(Meira geulakonigii)+TX、绿僵菌(Metarhizium anisopliae)(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(Myrothecium verrucaria)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(Paenibacillus polymyxa)+TX、成团泛菌(Pantoea agglomerans)(BlightBan C9-1®)+TX、泛菌属(Pantoea spp.)+TX、巴斯德氏芽菌属(Pasteuria spp.)(Econem®)+TX、Pasteuria nishizawae+TX、黄灰青霉(Penicillium aurantiogriseum)+TX、Penicillium billai(Jumpstart®+TX、TagTeam®)+TX、短密青霉(Penicillium brevicompactum)+TX、常现青霉(Penicillium frequentans)+TX、灰黄青霉(Penicillium griseofulvum)+TX、产紫青霉(Penicillium purpurogenum)+TX、青霉菌属(Penicillium spp.)+TX、纯绿色肯霉(Penicillium viridicatum)+TX、大伏革菌(Phlebiopsis gigantean)(Rotstop®)+TX、解磷细菌(phosphate solubilizing bacteria)(Phosphomeal®)+TX、隐地疫霉(Phytophthora

cryptogea)+TX、棕榈疫霉(Phytophthora palmivora)(Devine®)+TX、异常毕赤酵母(Pichia anomala)+TX、Pichia guilermondii+TX、膜醭毕赤氏酵母(Pichia membranaefaciens)+TX、指甲毕赤酵母(Pichia onychis)+TX、树干毕赤酵母(Pichia stipites)+TX、铜绿假单胞菌(Pseudomonas aeruginosa)+TX、致金色假单胞菌(Pseudomonas aureofasciens)(Spot-Less Biofungicide®)+TX、洋葱假单胞菌(Pseudomonas cepacia)+TX、绿针假单胞菌(Pseudomonas chlororaphis)(AtEze®)+TX、皱褶假单胞菌(Pseudomonas corrugate)+TX、荧光假单胞菌(Pseudomonas fluorescens)菌株A506(BlightBanA506®)+TX、恶臭假单胞菌(Pseudomonas putida)+TX、Pseudomonas reactans+TX、假单胞菌属(Pseudomonas spp.)+TX、丁香假单胞菌(Pseudomonas syringae)(Bio-Save®)+TX、绿黄假单胞菌(Pseudomonas viridiflava)+TX、荧光假单胞菌(Pseudomons fluorescens)(Zequanox®)+TX、Pseudozyma flocculosa菌株PF-A22UL(SporodexL®)+TX、纵沟柄锈菌(Puccinia canaliculata)+TX、Puccinia thlaspeos(Wood Warrior®)+TX、侧雄腐霉菌(Pythium paroecandrum)+TX、寡雄腐霉(Pythium oligandrum)(Polygandron®+TX、Polyversum®)+TX、缠器腐霉(Pythium periplocum)+TX、水生拉恩菌(Rhanella aquatilis)+TX、拉恩菌属(Rhanella spp.)+TX、根瘤菌(Rhizobia)(Dormal®+TX、Vault®)+TX、丝核菌属(Rhizoctonia)+TX、球状红球菌(Rhodococcus globerulus)菌株AQ719+TX、双倒卵形红冬孢酵母菌(Rhodosporidium diobovatum)+TX、圆红冬孢酵母菌(Rhodosporidium toruloides)+TX、红酵母属(Rhodotorula spp.)+TX、粘红酵母(Rhodotorula glutinis)+TX、禾本红酵母(Rhodotorula graminis)+TX、胶红酵母(Rhodotorula mucilagnosa)+TX、深红酵母(Rhodotorula rubra)+TX、酿酒酵母(Saccharomyces cerevisiae)+TX、玫瑰色盐水球菌(Salinococcus roseus)+TX、小核盘菌(Sclerotinia minor)+TX、小核盘菌(SARRITOR®)+TX、柱顶孢霉属(Scytalidium spp.)+TX、Scytalidium uredinicola+TX、甜菜夜蛾核型多角体病毒(Spodoptera exigua nuclear polyhedrosis virus)(Spod-X®+TX、Spexit®)+TX、粘质沙雷氏菌(Serratia marcescens)+TX、普城沙雷菌(Serratia plymuthica)+TX、沙雷氏菌属(Serratia spp.)+TX、粪生粪壳菌(Sordaria fimicola)+TX、海灰翅夜蛾核型多角体病毒(Spodoptera littoralis nucleopolyhedrovirus)(Littovir®)+TX、红掷孢酵母(Sporobolomyces roseus)+TX、嗜麦芽寡养单胞菌(Stenotrophomonas maltophilia)+TX、不吸水链霉菌(Streptomyces ahygroscopicus)+TX、白丘链霉菌(Streptomyces albaduncus)+TX、脱叶链霉菌(Streptomyces exfoliates)+TX、鲜黄链霉菌(Streptomyces galbus)+TX、灰平链霉菌(Streptomyces griseoplanus)+TX、灰绿链霉菌(Streptomyces griseoviridis)(Mycostop®)+TX、利迪链霉菌(Streptomyces lydicus)(Actinovate®)+TX、利迪链霉菌WYEC-108(ActinoGrow®)+TX、紫色链霉菌(Streptomyces violaceus)+TX、小铁艾酵母(Tilletiopsis minor)+TX、铁艾酵母属(Tilletiopsis spp.)+TX、棘孢木霉(Trichoderma asperellum)(T34Biocontrol®)+TX、盖姆斯木霉(Trichoderma gamsii)+TX、深绿木霉(Trichoderma atroviride)

(Plantmate®)+TX、钩状木霉(Trichoderma hamatum)TH 382+TX、里法哈茨木霉(Trichoderma harzianum rifai)(Mycostar®)+TX、哈茨木霉(Trichoderma harzianum)T-22(Trianum-P®+TX、PlantShieldHC®+TX、RootShield®+TX、Trianum-G®)+TX、哈茨木霉(Trichoderma harzianum)T-39(Trichodex®)+TX、非钩木霉(Trichoderma inhamatum)+TX、康宁木霉(Trichoderma koningii)+TX、木霉属(Trichoderma spp.)LC 52(Sentinel®)+TX、木素木霉(Trichoderma lignorum)+TX、长柄木霉(Trichoderma longibrachiatum)+TX、多孢木霉(Trichoderma polysporum)(Binab T®)+TX、紫杉木霉(Trichoderma taxi)+TX、绿色木霉(Trichoderma virens)+TX、绿色木霉(原来称为绿色粘帚霉(Gliocladium virens)GL-21)(SoilGuard®)+TX、绿色木霉(Trichoderma viride)+TX、绿色木霉菌株ICC 080(Remedier®)+TX、茁芽丝孢酵母(Trichosporon pullulans)+TX、毛孢子菌属(Trichosporon spp.)+TX、单端孢属(Trichothecium spp.)+TX、粉红单端孢(Trichothecium roseum)+TX、Typhula phacorrhiza菌株94670+TX、Typhula phacorrhiza菌株94671+TX、黑细基格孢(Ulocladium atrum)+TX、奥德曼细基格孢(Ulocladium oudemansii)(Botry-Zen®)+TX、玉蜀黍黑粉菌(Ustilago maydis)+TX、各种细菌和补充营养素(Natural II®)+TX、各种真菌(Millennium Microbes®)+TX、厚垣轮枝孢菌(Verticillium chlamydosporium)+TX、蜡蚧轮枝菌(Verticillium lecanii)(Mycotal®+TX、Vertalec®)+TX、Vip3Aa20(VIPtera®)+TX、Virgibaclillus marismortui+TX、野油菜黄单胞菌(Xanthomonas campestris pv.Poae)(Camperico®)+TX、伯氏致病杆菌(Xenorhabdus bovienii)+TX、嗜线虫致病杆菌(Xenorhabdus nematophilus);以及

[0504] 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(EF300®)+TX、丁香迷迭香和薄荷提取物的混合物(EF400®)+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

[0505] 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 FlyBait®+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

[0506] 宏生物剂，包括：短距蚜小蜂(Aphelinus abdominalis)+TX、阿尔蚜茧蜂(Aphidius ervi)(Aphelinus-System®)+TX、Acerophagus papaya+TX、二星瓢虫(Adalia bipunctata)(Adalia-System®)+TX、二星瓢虫(Adaline®)+TX、二星瓢虫(Adalia bipunctata)+TX、串茧跳小蜂(Ageniaspis citricola)+TX、巢蛾多胚跳小蜂(Ageniaspis fuscicollis)+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(Amblyseius cucumeris)(Thripex®+TX、Bugline cucumeris®)+TX、伪钝绥螨(Amblyseius fallacis)(Fallacis®)+TX、斯氏钝绥螨(Amblyseius swirskii)(Bugline swirskii®+TX、Swirskii-Mite®)+TX、奥氏钝绥螨(Amblyseius womersleyi)(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(Aphelinus abdominalis)(Apheline®+TX、Aphiline®)+TX、短翅蚜小蜂(Aphelinus asychis)+TX、科列马阿布拉小蜂(Aphidius colemani)(Aphipar®)+TX、阿尔蚜茧蜂(Aphidius ervi)(Ervipar®)+TX、烟蚜茧蜂(Aphidius gifuensis)+TX、桃赤蚜蚜茧蜂(Aphidius matricariae)(Aphipar-M®)+TX、食蚜瘿蚊(Aphidoletes aphidimyza)(Aphidend®)+TX、食蚜瘿蚊(Aphidoline®)+TX、岭南蚜小蜂(Aphytis lingnanensis)+

TX、印巴黄金蚜小蜂(Aphytis melinus)+TX、蠊卵长尾啮小蜂(Aprostocetus hagenowii)+TX、隐翅虫(Atheta coriaria)(Staphyline®)+TX、熊蜂属(Bombus spp.)+TX、欧洲熊蜂(Bombus terrestris)(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(Chrysoperla carnea)(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(Cotesia flavipes)+TX、菜蛾盘绒茧蜂(Cotesia plutellae)+TX、孟氏隐唇瓢虫(Cryptolaemus montrouzieri)(Cryptobug®+TX、Cryptoline®)+TX、日本方头甲(Cybocephalus nipponicus)+TX、西伯利亚离颚茧蜂(Dacnusa sibirica)+TX、西伯利亚离颚茧蜂(Dacnusa sibirica)(Minusa®)+TX、豌豆潜蝇姬小蜂(Diglyphus isaea)(Diminex®)+TX、小黑瓢虫(Delphastus catalinae)(Delphastus®)+TX、Delphastus pusillus+TX、Diachasmimorpha krausii+TX、长尾潜蝇茧蜂(Diachasmimorpha longicaudata)+TX、Diaparsis jucunda+TX、阿里食虱跳小蜂(Diaphorencyrtus aligarhensis)+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂(Diglyphus isaea)+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂(Diglyphus isaea)(Miglyphus®+TX、Digline®)+TX、西伯利亚离颚茧蜂(Dacnusa sibirica)(DacDigline®+TX、Minex®)+TX、歧脉跳小蜂属(Diversinervus spp.)+TX、盾蚧长缨蚜小蜂(Encarsia citrina)+TX、丽蚜小蜂(Encarsia formosa)(Encarsia max®+TX、Encarline®+TX、En-Strip®)+TX、浆角蚜小蜂(Eretmocerus eremicus)(Enermix®)+TX、哥德恩蚜小蜂(Encarsia guadeloupae)+TX、海地恩蚜小蜂(Encarsia haitiensis)+TX、细扁食蚜蝇(Episyrphus balteatus)(Syrphidend®)+TX、Eretmoceris siphonini+TX、浆角蚜小蜂(Eretmocerus californicus)+TX、浆角蚜小蜂(Eretmocerus eremicus)(Ercal®+TX、Eretline e®)+TX、浆角蚜小蜂(Eretmocerus eremicus)(Bemimix®)+TX、海氏桨角蚜小蜂(Eretmocerus hayati)+TX、蒙氏桨角蚜小蜂(Eretmocerus mundus)(Bemipar®+TX、Eretline m®)+TX、Eretmocerus siphonini+TX、四斑光缘瓢虫(Exochomus quadripustulatus)+TX、食螨瘿蚊(Feltiella acarisuga)(Spidend®)+TX、食螨瘿蚊(Feltiella acarisuga)(Feltiline®)+TX、阿里山潜蝇茧蜂(Fopius arisanus)+TX、Fopius ceratitivorus+TX、芒柄花黄素(Formononetin)(Wirless Beehome®)+TX、细腰凹蓟马(Franklinothrips vespiformis)(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(Habrobracon hebetor)+TX、异色瓢虫(Harmonia axyridis)(HarmoBeetle®)+TX、异小杆线虫属(Heterorhabditis spp.)(Lawn Patrol®)+TX、嗜菌异小杆线虫(Heterorhabditis

bacteriophora)(NemaShield HB®+TX、Nemaseek®+TX、Terranem-Nam®+TX、Terranem®+TX、Larvanem®+TX、B-Green®+TX、NemAttack ®+TX、Nematop®)+TX、大异小杆线虫(Heterorhabditis megidis)(Nemasys H®+TX、BioNem H®+TX、Exhibitline hm®+TX、Larvanem-M®)+TX、集栖瓢虫(Hippodamia convergens)+TX、尖狭下盾螨(Hypoaspis aculeifer)(Aculeifer-System®+TX、Entomite-A®)+TX、兵下盾螨(Hypoaspis miles)(Hypoline m®+TX、Entomite-M®)+TX、黑色枝跗瘿蜂(Lbalia leucospoides)+TX、Lecanoideus floccissimus+TX、Lemophagus errabundus+TX、三色丽突跳小蜂(Leptomastidea abnormis)+TX、Leptomastix dactylopii(Leptopar®)+TX、长角跳小蜂(Leptomastix epona)+TX、Lindorus lophanthae+TX、Lipolexis oregmae+TX、叉叶绿蝇(Lucilia caesar)(Natufly®)+TX、茶足柄瘤蚜茧蜂(Lysiphlebus testaceipes)+TX、暗黑长脊盲蝽(Macrolophus caliginosus)(Mirical-N®+TX、Macroline c®+TX、Mirical®)+TX、Mesoseiulus longipes+TX、黄色阔柄跳小蜂(Metaphycus flavus)+TX、Metaphycus lounsburyi+TX、角纹脉褐蛉(Micromus angulatus)(Milacewing®)+TX、黄色花翅跳小蜂(Microterys flavus)+TX、Muscidifurax raptorellus和Spalangia cameroni(Biopar®)+TX、Neodryinus typhlocybae+TX、加州新小绥螨(Neoseiulus californicus)+TX、瓜钝绥螨(Neoseiulus cucumeris)(THRYPEX®)+TX、虚伪新小绥螨(Neoseiulus fallacis)+TX、Nesideocoris tenuis(NesidioBug®+TX、Nesibug®)+TX、古铜黑蝇(Ophyra aenescens)(Biofly®)+TX、狡小花蝽(Orius insidiosus)(Thripor-I®+TX、Orilinei®)+TX、无毛小花蝽(Orius laevigatus)(Thripor-L®+TX、Orilinel®)+TX、大型小花蝽(Orius majusculus)(Oriline m®)+TX、小黑花椿象(Orius strigicollis)(Thripor-S®)+TX、Pauesia juniperorum+TX、酸酱瓢虫腹柄姬小蜂(Pediobius foveolatus)+TX、Phasmarhabditis hermaphrodita(Nemaslug®)+TX、Phymastichus coffea+TX、Phytoseiulus macropilus+TX、智利小植绥螨(Phytoseiulus persimilis)(Spidex®+TX、Phytoline p®)+TX、斑腹刺益蝽(Podisus maculiventris)(Podisus®)+TX、Pseudacteon curvatus+TX、Pseudacteon obtusus+TX、Pseudacteon tricuspis+TX、Pseudaphycus maculipennis+TX、Pseudleptomastix mexicana+TX、具毛嗜木虱跳小蜂(Psyllaephagus pilosus)+TX、同色短背茧蜂(Psyttalia concolor)(complex)+TX、胯姬小蜂属(Quadrastichus spp.)+TX、Rhyzobius lophanthae+TX、澳洲瓢虫(Rodolia cardinalis)+TX、Rumina decollate+TX、Semielacher petiolatus+TX、麦长管蚜(Sitobion avenae)(Ervibank®)+TX、小卷蛾斯氏线虫(Steinernema carpocapsae)(Nematac C®+TX、Millenium®+TX、BioNem C®+TX、NemAttack®+TX、Nemastar®+TX、Capsanem®)+TX、夜蛾斯氏线虫(*NemaShield*®+TX、Nemasys *F*®+TX、BioNem *F*®+TX、Steinernema-*System*®+TX、*NemAttack*®+TX、*Nemaplus*®+TX、Exhibitline *sf*®+TX、Scia-*rid*®+TX、*Entonem*®)+TX、锯蜂线虫(Steinernema kraussei)(Nemasys L®+TX、

BioNem L®+TX、Exhibitline srb®)+TX、里奥布拉夫线虫(Steinernema riobrave)(BioVector®+TX、BioVektor®)+TX、蝂蛄斯氏线虫(Steinernema scapterisci)(Nematac S®)+TX、斯氏线虫属(Steinernema spp.)+TX、Steinernematid属(Guardian Nematodes®)+TX、深点食螨瓢虫(Stethorus punctillum)(Stethorus®)+TX、亮腹釉小蜂(Tamarixia radiate)+TX、Tetrastichus setifer+TX、Thripobius semiluteus+TX、中华长尾小蜂(Torymus sinensis)+TX、甘蓝夜蛾赤眼蜂(Trichogramma brassicae)(Tricholine b®)+TX、甘蓝夜蛾赤眼蜂(Trichogramma brassicae)(TrichoStrip®)+TX、广赤眼蜂(Trichogramma evanescens)+TX、微小赤眼蜂(Trichogramma minutum)+TX、玉米螟赤眼蜂(Trichogramma ostriniae)+TX、宽脉赤眼蜂(Trichogramma platneri)+TX、短管赤眼蜂(Trichogramma pretiosum)+TX、螟黑点瘤姬蜂(Xanthopimpla stemmator);以及

[0507] 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、δ陷阱(Delta trap)(Trapline d®)+TX、解淀粉欧文氏菌(Harpin)(ProAct®+TX、Ni-HIBIT Gold CST®)+TX、磷酸高铁(Ferramol®)+TX、漏斗陷阱(Trapline y®)+TX、Gallex®+TX、Grower's Secret®+TX、高油菜素内酯+TX、磷酸铁(Lilly Miller Worry 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(Semaspore Organic Grasshopper Control®)+TX、粘着陷阱(Trapline YF®+TX、Rebell Amarillo®)+TX以及陷阱(Takitrapline y+b®)+TX。

[0508] 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]"[杀有害生物剂手册-一本世界手册;第13版;编辑:C.D.S.TomLin;The British Crop Protection Council[英国农作物保护委员会]]中时,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。

[0509] 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”，则使用替代名称。“CAS登记号”意指化学文摘登记号。

[0510] 选自本发明表1至表96和表A的具有式(I)的化合物与上述活性成分的活性成分混合物包含选自表1至表96和表A的化合物和如上所述的活性成分，优选地处于从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，甚至更尤其是从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。

[0511] 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。

[0512] 包含选自表1至表96以及表P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)(诸如“桶混制剂”)施用，并且当以顺序的方式(即，一个在另一个适度短的时期之后，诸如几小时或几天)施用时组合使用这些单独活性成分来施用。施用选自表1至表96和表P的具有式(I)的化合物和如上所述活性成分的顺序对于实施本发明并不是至关重要的。

[0513] 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。

[0514] 根据本发明的组合物是以本身已知的方式，在不存在助剂的情况下，例如通过研磨、筛选和/或压缩固体活性成分；和在至少一种助剂的存在下，例如通过紧密混合活性成分与一种或多种助剂和/或将活性成分与一种或多种助剂一起研磨来制备。用于制备组合物的这些方法和用于制备这些组合物的化合物I的用途也是本发明的主题。

[0515] 组合物的施用方法、也就是说控制以上提及的类型的有害生物的方法，诸如喷洒、雾化、喷粉、涂刷、敷料、散射或浇注，选择这些方式以适合当时环境的既定目标；并且这些组合物用于控制以上提及的类型的有害生物的用途是本发明的其他主题。典型的浓度比是在0.1与1000ppm之间，优选在0.1与500ppm之间的活性成分。每公顷的施用量总体上是每公顷1g到2000g活性成分，尤其是10g/ha到1000g/ha，优选地10g/ha到600g/ha。

[0516] 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，该活性成分可以经由根系统(内吸作用)到达植物，这是通过用液体组合物将这些植物的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加入淹水的稻田中。

[0517] 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，诸如

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包衣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，诸如在每100kg种子10克至100克之间。

[0518] 术语种子包括所有种类的种子以及植物繁殖体，包括但并不限于真正的种子、种子块、吸盘、谷粒、鳞球茎、果实、块茎、谷物、根茎、插条、切割枝条以及类似物并且在一个优选的实施例中是指真正的种子。

[0519] 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。

[0520] 种子处理包括本领域中已知的所有适合的种子处理技术，诸如拌种、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，诸如，在这些种子播种之前或播种/种植过程中喷雾或通过撒粉。

[0521] 本发明进一步涉及一种用于控制有害生物的方法，该方法包括将根据本发明所述的组合物施用于该有害生物或其环境中，优选地除了通过手术或疗法用于处理人体或动物体的方法以及对人体或动物体实施的诊断方法之外。

[0522] 本发明进一步涉及一种用于保护植物繁殖材料免受有害生物攻击的方法，该方法包括用包括根据本发明所述化合物的组合物或用根据本发明所述化合物处理该繁殖材料或该繁殖材料所种植的场所。本发明进一步涉及用包括根据本发明所述化合物的杀有害生物组合物或用根据本发明所述化合物处理过的植物繁殖材料。

[0523] 接下来的实例用来阐明本发明。本发明的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或0.8ppm来证实。温度以摄氏度给出；溶剂的混合比率以体积份给出。

[0524] 制备实例：

[0525] “Mp”是指以℃计的熔点。自由基表示甲基基团。^{1}H NMR测量值在Brucker 400MHz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。

[0526] 以下的LC-MS方法用来表征这些化合物：

[0527] 方法A

MS	在来自沃特斯的质谱仪（SDQ或SQDII单四极杆质谱仪）上记录光谱，该质谱仪配备有电喷射源（极性：正离子或负离子，毛细管：3.00 kV，锥孔范围：30 V，萃取器：2.00 V，源温度：150°C，去溶剂化温度：350°C，锥孔气体流量：0 L/Hr，去溶剂化气体流量：650 L/Hr；质量范围：100 Da至900 Da）。
LC	来自沃特斯公司的Acquity UPLC：二元泵，加热管柱室以及二极管阵列检测器。溶剂脱气装置，二元泵，加热管柱室以及二极管阵列检测器。柱：沃特斯UPLC HSS T3，1.8 μm，30×2.1 mm，温度：60°C；DAD波长范围（nm）：210至500，溶剂梯度：A = 水 + 5% MeOH + 0.05% HCOOH，B = 乙腈 + 0.05% HCOOH；梯度：0 min 0% B，100%A；1.2-1.5 min 100% B；流量（ml/min）0.85。

[0528]

[0529] 方法B

MS	在来自沃特斯的质谱仪（SDQ或SQDII单四极杆质谱仪）上记录光谱，该质谱仪配备有电喷射源（极性：正离子或负离子，毛细管：3.00 kV，锥孔范围：45 V，萃取器：2.00 V，源温度：150°C，去溶剂化温度：350°C，锥孔气体流量：0 L/Hr，去溶剂化气体流量：650 L/Hr；质量范围：100 Da至900 Da）。
LC	来自沃特斯公司的Acquity UPLC：二元泵，加热管柱室以及二极管阵列检测器。溶剂脱气装置，二元泵，加热管柱室以及二极管阵列检测器。柱：沃特斯UPLC HSS T3，1.8 μm，30×2.1 mm，温度：60°C；DAD波长范围（nm）：210至500，溶剂梯度：A = 水 + 5% MeOH + 0.05% HCOOH，B = 乙腈 + 0.05% HCOOH；梯度：0 min 0% B，100%A；1.2-1.5 min 100% B；流量（ml/min）0.85。

[0530]

[0531] 方法C

MS	在来自沃特斯的质谱仪（SDQ、SQDII单四极杆质谱仪）上记录光谱，该质谱仪配备有电喷射源（极性：正离子和负离子，毛细管：3.00 kV，锥孔范围：30V，萃取器：2.00 V，源温度：150°C，去溶剂化温度：350°C，锥孔气体流量：50 l/h，去溶剂化气体流量：650 l/h；质量范围：100 Da至900 Da）
LC	来自沃特斯公司的Acquity UPLC：二元泵，加热管柱室、二极管阵列检测器以及ELSD检测器。柱：沃特斯UPLC HSS T3，1.8 μm，30×2.1 mm，温度：60°C；DAD波长范围（nm）：210至500，溶剂梯度：A = 水 + 5% MeOH + 0.05% HCOOH，B = 乙腈 + 0.05% HCOOH；梯度：10%-100%

[0532]

	B，在2.7 min内；流量（ml/min）0.85

[0533]

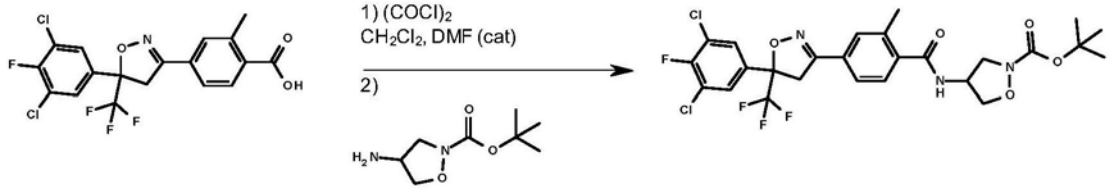
[0534] 方法D

[0535]

MS	在沃特斯SQD2质谱仪（单四极杆质谱仪）上记录光谱，电离方法：电喷雾，极性：正离子 毛细管（kV）3.50，锥孔（V）30.00，提取器（V）3.00，源温度（°C）150，脱溶剂气温度（°C）400，锥孔反吹气流（L/Hr）60，脱溶剂气流（L/Hr）700，质量范围：140至800 Da；DAD波长范围（nm）：210至400
LC	方法：用以下HPLC梯度条件的沃特斯ACQUITY UPLC （溶剂A：水/甲醇9：1，0.1%甲酸和溶剂B：乙腈，0.1%甲酸） 时间（分钟） A（%） B（%） 流速（ml/min） 0 100 0 0.75 2.5 0 100 0.75 2.8 0 100 0.75 3.0 100 0 0.75 柱类型：沃特斯ACQUITY UPLC HSS T3；柱长：30 mm；柱内径：2.1 mm；颗粒尺寸：1.8微米；温度：60°C。

[0536] 实例1:N-(2-环丁基磺酰基异噁唑烷-4-基)-4-[5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酰胺(表A中的实例A014)

[0537] 步骤A:4-[[4-[5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酰基]氨基]异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯

[0538] 

[0539] 将4-氨基异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯(描述于WO 11/067272中的制备)(0.377g)在四氢呋喃(5ml)中的溶液用三乙胺(0.307g)进行处理并且在20℃下搅拌。缓慢添加相当数量的溶解于四氢呋喃(5ml)中的4-[5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酰氯(0.911g)(4-[5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酸的制备描述于WO 13/026695中)。将该混合物搅拌一小时,然后将其用二氯甲烷和碳酸氢钠水溶液进行稀释。分离各相并且将该水层用二氯甲烷萃取。合并有机相,经硫酸钠干燥并蒸发,以产出呈黄色固体的粗产物。在硅胶上用乙酸乙酯-庚烷混合物(1:1)进行快速层析,给出呈淡黄色固体状的标题化合物。1H-NMR(CDCl3,400MHz,以ppm计的δ):7.58(d,2H),7.54-7.46(m,2H),7.40(d,1H),6.25(d,1H),5.02(m,1H),4.12-3.95(m,4H),3.72-3.57(m,2H),2.47(s,3H),1.49(s,9H)。

[0540] 步骤B:4-[5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-异噁唑烷-2-鎓-4-基-2-甲基-苯甲酰胺;2,2,2-三氟乙酸盐

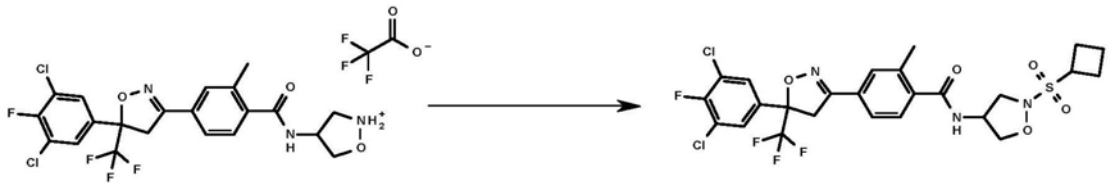
[0541] 

[0542] 将4-[[4-[5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酰基]氨基]异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯(1.00g)在二氯甲烷(8.5ml)中的溶液用三氟乙酸(0.945g)进行处理并且在20℃下搅拌16小时。将该反应随后在硅胶上进行TLC分析,用甲醇-乙酸乙酯(5/95)洗脱。

[0543] 将该反应混合物在减压下进行浓缩并且使该残余物经受硅胶快速层析法,用甲醇-乙酸乙酯(0:10比1:9)洗脱。在蒸发所选部分之后,获得黄色粉末状的标题化合物。

[0544] 1H-NMR(CDCl3,400MHz,以ppm计的δ):8.40-8.10(brs,2H),7.58(d,2H),7.52-7.45(m,3H),5.17(m,1H),4.30(m,1H),4.20(m,1H),4.08(d,1H),3.70(m,2H),3.60(m,1H),2.40(s,3H)。

[0545] 步骤C:N-(2-环丁基磺酰基异噁唑烷-4-基)-4-[5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酰胺

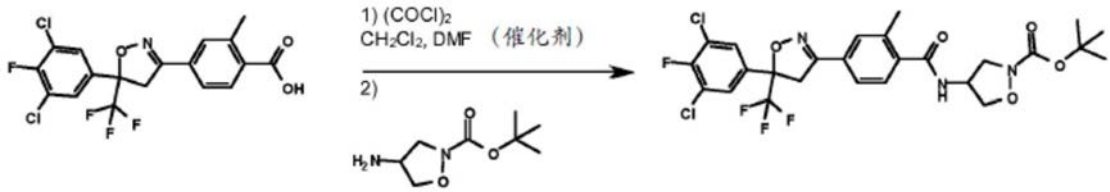
[0546] 

[0547] 在氩气氛下,将4-[5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-异噁唑烷-2-鎓-4-基-2-甲基-苯甲酰胺;2,2,2-三氟乙酸盐(在步骤B中描述的)(0.150g,)在四氢呋喃(5.0ml)中的溶液用吡啶(0.038g)和环丁烷磺酰氯(cyclubutane sulfonyl chloride)(0.187g)进行处理。在20℃下,将该反应混合物搅拌18小时。将该反应随后进行TLC(硅胶,乙酸乙酯/庚烷1:1)。将该反应混合物在减压下进行蒸发并且使该残余物经受硅胶快速柱色谱法,用乙酸乙酯/庚烷(1:1)洗脱。蒸发所选部分,以产生呈无色固体的标题化合物(表A中的实例A014)。

[0548] 1H-NMR(CDCl3,400MHz,以ppm计的δ):7.60(d,2H),7.52-7.40(m,3H),6.97(d,1H),5.32(m,1H),4.45(t,1H),4.27(dd,1H),4.10-3.95(m,3H),3.73-3.63(m,2H),2.49(s,3H),1.30-1.15(m,2H),0.75(d,2H),0.45(m,2H)。

[0549] 实例2:4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺(表A中的实例A001)

[0550] 步骤A:4-[[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]异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯

[0551] 

[0552] 按照如实例1的步骤A中所述类似的条件,但以富立体异构的酸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-苯甲酸开始(描述于WO 2013026931中),制备为非对映异构体的混合物的4-[[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]异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯。

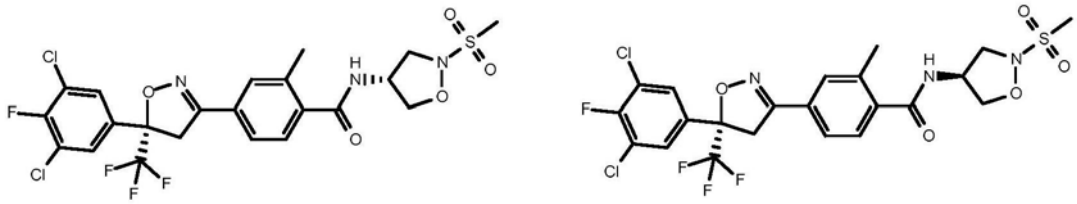
[0553] ^{1}HNMR(CDCl3,400MHz):7.59(s,1H),7.58(s,1H),7.53-7.47(m,2H),7.38(d,J=

8Hz,1H),6.24(d,J＝8Hz,1H),5.05-4.97(m,1H),4.12-4.01(m,3H),3.97(dd,J1＝10Hz,J2＝3Hz,1H),3.68(d,J＝17Hz,1H),3.60(dd,J1＝12Hz,J2＝3Hz,1H),2.46(s,3H),1.48(s,9H)。

[0554] 步骤B和步骤C: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-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺

[0555] 类似于实例1的步骤B和步骤C,但使用甲磺酰氯代替环丁基磺酰氯,得到呈非对映异构体的混合物的标题化合物(表A中的化合物A001)(该表中的LC-MS数据)。

[0556] 实例3:单一非对映体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-N-[(4R)-2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺(表A中的实例A013)和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-N-[(4S)-2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺(表A中的实例A012)

[0557] 

[0558] 使该中间产物,在制备实例2步骤A中得到的4-[[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]异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯,通过制备型HPLC层析法经受手性拆分,使用以下所列出的条件。

[0559] 分析型HPLC方法:

[0560] HPLC:沃特斯UPLC-HClass,DAD检测器沃特斯UPLC

[0561] 柱:Daicel CHIRALPAK®IB,3μm,0.46cm×10cm

[0562] 流动相:Hept/EtOH 90/10

[0563] 流速:1.0ml/min

[0564] 检测:265nm

[0565] 样品浓度:1mg/mL,在DCM/iPrOH 50/50中

[0566] 注射:2μl

[0567] 制备型HPLC方法:

[0568] 来自沃特斯的自动纯化系统:2767样品管理器,2489紫外/可见检测器,2545四元梯度模块。

[0569] 柱:Daicel CHIRALPAK®IB,5μm,1.0cm×25cm

[0570] 流动相:Hept/EtOH 90/10

[0571] 流速:10ml/min

[0572] 检测:UV 260nm

[0573] 样品浓度:50mg/mL,在(4ml庚烷/2ml EtOH)中

[0574] 注射:250μl-500μl

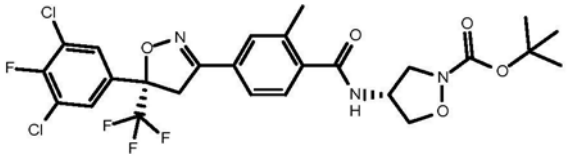
[0575] 结果:

[0576]

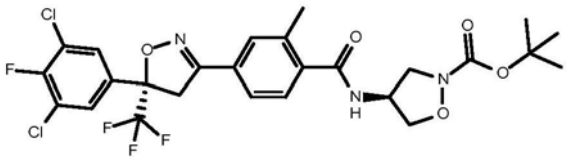
第一洗脱对映异构体	第二洗脱对映异构体
保留时间(min)约6.68	保留时间(min)约10.79

化学纯度(在265nm处的面积%)99	化学纯度(在265nm处的面积%)99
对映异构体过量(%)>99	对映异构体过量(%)>99

[0577] 洗脱时间为6.68min时,中间产物是(4R)-4-[[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]异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯

[0578] 

[0579] 而洗脱时间为10.79min时,中间产物是(4S)-4-[[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]异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯。

[0580] 

[0581] 使各个非对映异构体经受合成步骤B和C(如对于制备实例2所描述的),以分别产出:

[0582] 在以下描述的条件下保留时间为21.71min时,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-N-[(4R)-2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺(表A中的实例A013)

[0583] 并且

[0584] 在相同条件下保留时间为17.61min时,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-N-[(4S)-2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺(表A中的实例A012)。

[0585] 分析方法:

[0586] HPLC:沃特斯UPLC-HClass

[0587] DAD检测器:沃特斯UPLC

[0588] 柱:Daicel CHIRALPAK® IB,3μm,0.46cm×10cm

[0589] 流动相:庚烷/EtOH 90/10

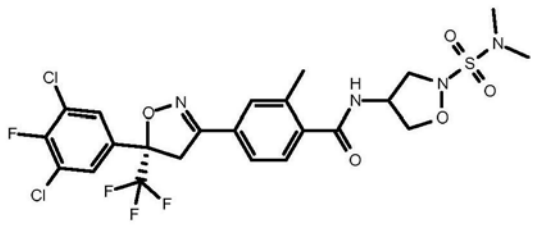
[0590] 流速:1.0ml/min

[0591] 检测:265nm

[0592] 样品浓度:1mg/mL,在DCM/iPr 50/50中

[0593] 注射:2μL

[0594] 实例4:4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺(表A中的实例A010)

[0595] 

[0596] 遵循与合成实例2中完全相同的合成顺序，但使用二甲基胺磺酰氯代替甲磺酰氯，制备呈非对映异构体的混合物的标题化合物。LC-MS数据在表A中示出。

[0597] 在下述条件下，使该混合物通过手性HPLC经受制备性分离。

[0598] 分析型HPLC方法：

[0599] HPLC：沃特斯UPLC-HClass，DAD检测器沃特斯UPLC

[0600] 柱：Daicel CHIRALPAK® IA，3μm，0.46cm×10cm

[0601] 流动相：TBME/EtOH 98/02

[0602] 流速：1.0ml/min

[0603] 检测：265nm

[0604] 样品浓度：1mg/mL，在DCM/iPrOH 50/50中

[0605] 注射：2μl

[0606] 制备型HPLC方法：

[0607] 来自沃特斯的自动纯化系统：2767样品管理器，2489紫外/可见检测器，2545四元梯度模块。

[0608] 柱：Daicel CHIRALPAK® Ia，5μm，1.0cm×25cm

[0609] 流动相：TBME/EtOH 98/02

[0610] 流速：10ml/min

[0611] 检测：UV 260nm

[0612] 样品浓度：25mg/mL，在二氯甲烷中，经过滤

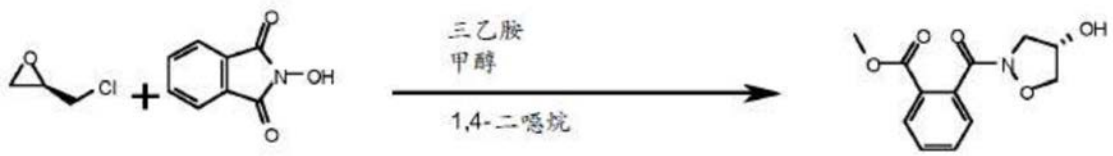
[0613] 注射：100μl-200μl

[0614]

第一洗脱对映异构体（表A中的化合物A143）	第二洗脱对映异构体（表A中的化合物A034）
保留时间（min）约3.6	保留时间（min）约4.77
化学纯度（在266 nm处的面积%）99	化学纯度（在266 nm处的面积%）99
对映异构体过量（%）>99	对映异构体过量（%）>99

[0615] 实例5：2-氯-N-[(4R)-2-(环丙基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺(表A中的化合物A154)

[0616] 步骤A：2-[(4S)-4-羟基异噁唑烷-2-羰基]苯甲酸甲酯

[0617] 

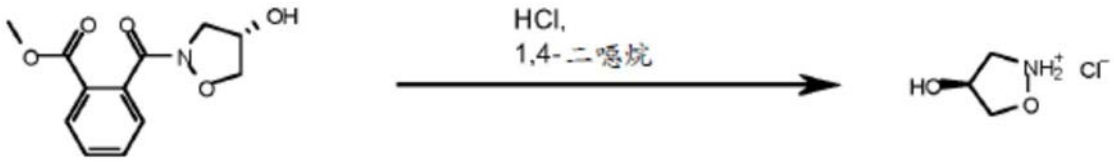
[0618] 在配备有机械搅拌器、冷凝器、温度计的磺化烧瓶中，在惰性气氛下，将N-羟基邻苯二甲酰亚胺(40.0g)和(R)-(-)-环氧氯丙烷(25.0g)在无水1,4-二噁烷(240mL)中的悬浮液用三乙胺(3.42mL)进行处理。该悬浮液立即变为橙色。然后，将所得的混合物加热至55℃并且在此温度下搅拌6天。向所得的暗红色溶液中添加甲醇(240mL)和三乙胺(34.2mL)，并且在相同的温度下继续搅拌3小时。

[0619] 然后，将该反应混合物真空浓缩，以产生暗红色的油，将该油用一点儿二氯甲烷和

饱和的碳酸氢钠水溶液进行处理。用二氯甲烷萃取该混合物两次。将有机相经硫酸钠干燥并且在减压下进行蒸发。使该残余物经受硅胶层析法，使用甲醇/二氯甲烷(5:95)作为洗脱液。蒸发所选部分，并且用乙酸乙酯磨碎残余物。缓慢形成白色悬浮液。通过过滤分离2-[(4S)-4-羟基异噁唑烷-2-羰基]苯甲酸甲酯。

[0620] ^{1}HNMR(CDCl3,400MHz):7.99(d,J＝8Hz,1H),7.62(t,J＝8Hz,1H),7.51-7.42(m,2H),4.81-4.72(m,1H),4.35-3.63(m,4H),3.92(s,3H)。

[0621] 步骤B:(4S)-异噁唑烷-2-鎓-4-醇氯化物

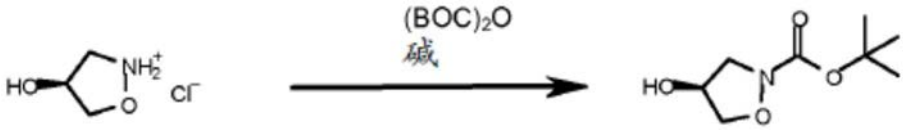
[0622] 

[0623] 将2-[(4S)-4-羟基异噁唑烷-2-羰基]苯甲酸甲酯(264g)置于配备有机械搅拌器、冷凝器、温度计以及经由鼓泡器的惰性气体入口和出口的烧瓶中。添加4摩尔的盐酸在二噁烷(1.313L)中的无水溶液。将得到的溶液在80℃搅拌20小时。注意捕获离开装置的氯化氢气体。

[0624] 然后将该反应混合物冷却至0℃，并且通过仔细过滤分离所形成的固体。在用干燥二噁烷进行冲洗并干燥之后，分离出呈无色粉末的(4S)-异噁唑烷-2-鎓-4-醇氯化物。通过NMR分析该化合物。

[0625] ^{1}HNMR(DMSO-d6,400MHz):13.1-12.1(br s,2H),6.2-5.2(br s,1H),4.85-477(m,1H),4.08(d,1H),4.04(dd,1H),3.49(dd,1H),3.33(d,1H)。

[0626] 步骤C:(4S)-4-羟基异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯

[0627] 

[0628] 在惰性气氛下，将(4S)-异噁唑烷-2-鎓-4-醇氯化物(67.8g)在干四氢呋喃(300mL)中的悬浮液在0℃下搅拌。经10分钟的时间加入三乙胺(82g)在四氢呋喃(100mL)中的溶液。然后，将二碳酸二叔丁酯(141g)在四氢呋喃(100mL)中的溶液添加到该反应混合物中。在去除冰浴之后，将该反应混合物在室温下搅拌，直至起始材料反应。

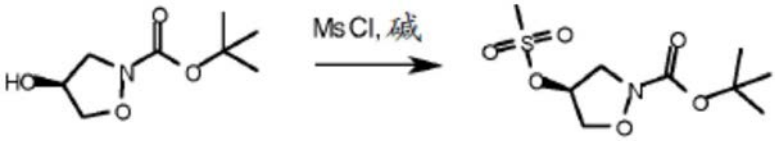
[0629] 通过对用乙酸乙酯/庚烷(1:1)的混合物在硅胶板上洗脱的整分试样进行TLC分析来监测反应进展。可以用碘蒸气或茚三酮使该板显影。

[0630] 过滤该反应混合物，并且用四氢呋喃洗涤沉淀物。将滤液在真空下浓缩，并且将残余物在使用第一梯度庚烷/乙酸乙酯(3:1至1:3)的硅胶柱上纯化。

[0631] 分离出呈浅黄色油状的(4S)-4-羟基异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯，其特征在于它的NMR光谱。

[0632] ^{1}HNMR(CDCl3,400MHz):4.78-4.74(m,1H),3.96-3.94(m,2H),3.72-3.68(m,2H),2.36(宽d,1H),1.48(s,9H)。

[0633] 步骤D:(4S)-4-甲基磺酰基氧基异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯

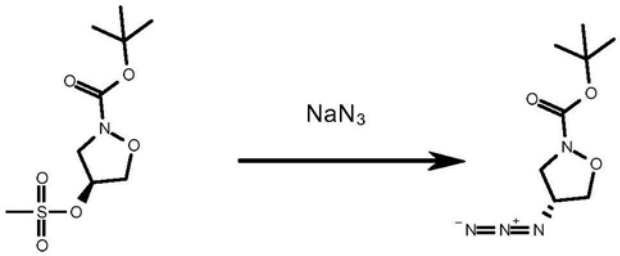
[0634] 

[0635] 向(4S)-4-羟基异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯(5.00g)在二氯甲烷(30mL)中的溶液中添加三乙胺(7.52mL)。将该反应烧瓶在冰浴中冷却,并且以使温度保持低于20℃的这样一种方式缓慢添加甲磺酰氯(3,13mL)在二氯甲烷(10mL)中的溶液。将所得橙色悬浮液在20℃下搅拌16小时并且得到棕色悬浮液。

[0636] 然后,将反应混合物用1M水性盐酸(30ml)洗涤,并且将水相用二氯甲烷萃取。将合并的有机萃取物用1M水性氢氧化钠(30mL)洗涤。将水相用二氯甲烷萃取,并且将合并的有机萃取物经硫酸钠干燥并且在真空下浓缩,以给出粗(4S)-4-甲基磺酰基氧基异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯,其纯度足以用于以下步骤。

[0637] ^{1}HNMR(CDCl3,400MHz):5.53-5.47(m,1H),4.20-4.15(宽d,J=10Hz,1H),4,11-4.05(dd,J_1=10Hz,J_2=5Hz,1H),4.03-3.97(宽d,J=14Hz,1H),3.89-3.82(dd,J_1=14Hz,J_2=5Hz,1H),3.07(s,3H),1.50(s,9H)。

[0638] 步骤E:(4R)-4-叠氮基异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯

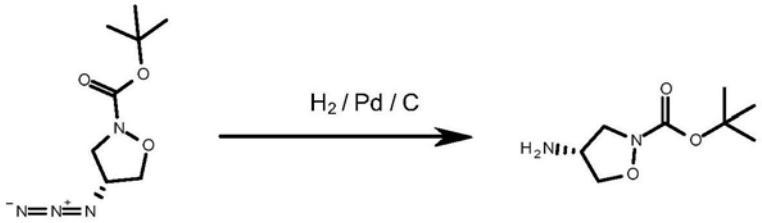
[0639] 

[0640] 将叠氮化钠(21.5g)悬浮于在配备有机械搅拌器、温度计、冷凝器、具有鼓泡器的氩气入口和出口和滴液漏斗的500mL烧瓶中的170mL的二甲基甲酰胺(经分子筛干燥)中。将该反应烧瓶放置在油浴中并在60℃下在搅拌下加热。在氩气氛下和在安全屏障后进行该反应。为安全起见,特别注意起始甲磺酸盐中氯化溶剂微量的缺少。在搅拌下,添加(4S)-4-甲基磺酰基氧基异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯(以上所述)(68g)在干燥二甲基甲酰胺(170mL)中的溶液。没有观察到放热。在完成添加以后,在相同温度下搅拌该反应混合物22小时。可以通过TLC分析来跟踪反应进展(硅胶板,洗脱液乙酸乙酯-庚烷1:1,Rf起始材料0.3,Rf产物0.6)。

[0641] 然后,将该反应混合物冷却至室温并且在水(1L)和乙酸乙酯的混合物中转移。将所得混合物用乙酸乙酯萃取三次。将合并的有机萃取物用水洗涤三次,然后用盐水洗涤,然后经硫酸钠干燥。在真空下去除溶剂后,得到呈浅橙色油状物的粗(4R)-4-叠氮基异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯。将其不经纯化用于下一步骤。

[0642] ^{1}HNMR(CDCl3,400MHz):4.47-4.42(m,1H),4.07-4.01(dd,1H),3.97-3.92(dd,1H),3.80-3.77(d,2H),1.51(s,9H)。

[0643] 步骤F:(4R)-4-氨基异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯

[0644] 

[0645] 将(4R)-4-叠氮基异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯(56g)在四氢呋喃(1300mL)中的溶液置于配备有机械搅拌器的惰性化的高压灭菌器中。引入钯碳(2.50g,5%催化剂装填)并且将反应器闭合。在将反应器中的空气排空之后,引入氢(重复这一操作两次)。所施加的压力不超过3atm。在室温下,在强力搅拌下进行该反应。通过对反应混合物的整分试样进行分析来检查进展(在真空下去除氢并用氩充满反应器后)。在8小时之后,引入另一部分的催化剂(1.25g),遵循安全协议,并且再继续氢化两小时,这之后该转化完成。在将反应器惰性化之后,将该反应混合物经短距的硅藻土过滤,并且将滤液在60℃下在旋转蒸发器上蒸发。得到呈淡棕色油的粗(4R)-4-氨基异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯。

[0646] ^{1}HNMR(CDCl3,400MHz):4.00-3.89(m,2H),3.87-3.80(dd,1H),3.70-3.65(dd,1H),3.38-3.33(dd,1H),1.48(s,9H)。

[0647] (4R)-4-氨基异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯的对映异构体纯度:在手性HPLC上进行产物的手性分析,使用外消旋化合物作为参考。

[0648] HPLC:沃特斯UPLC-HClass

[0649] DAD检测器:沃特斯UPLC

[0650] 柱:Daicel CHIRALPAK® IF,3μm,0.46cm×10cm

[0651] 流动相:庚烷/EtOH/DEA 80/20/0.1%

[0652] 流速:1.0ml/min

[0653] 检测:220nm

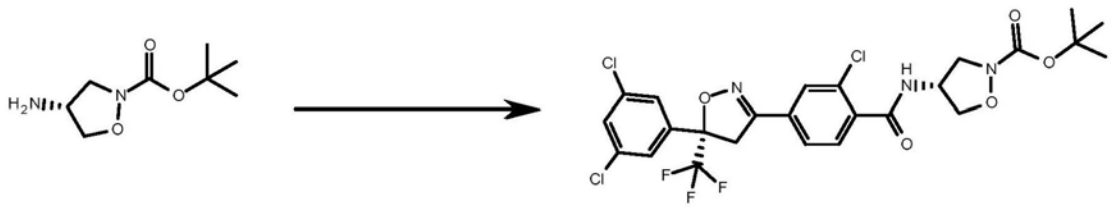
[0654] 样品浓度:1mg/mL,在iPrOH中100%

[0655] 注射:2μL

[0656] 在这些条件下,对映异构体分别具有5.99min和9.69min的保留时间。

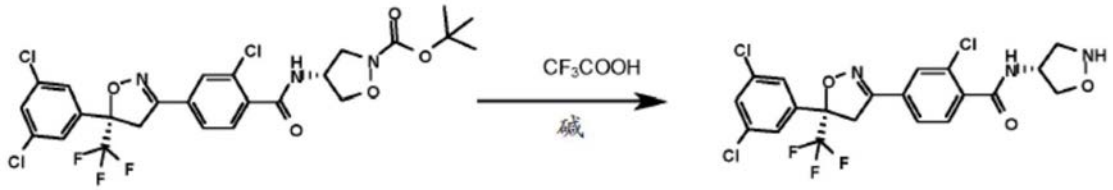
[0657] 如以上所描述获得的产物仅显示出短保留时间的峰,未检测出其他异构体。

[0658] 步骤G:(4R)-4-[[2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰基]氨基]异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯

[0659] 

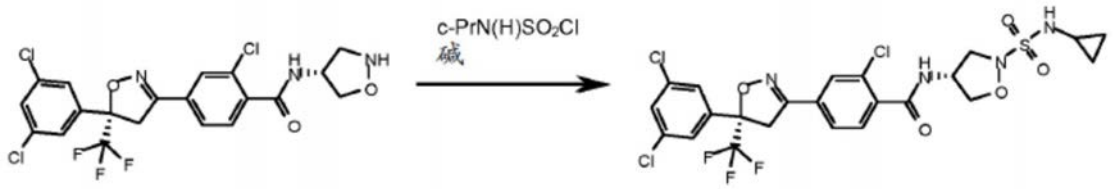
[0660] 按如先前实例中所描述的类似方式进行该步骤。

[0661] 步骤H:2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺

[0662] 

[0663] 按如先前实例中所描述的类似方式进行该步骤。

[0664] 步骤I:N-[(4R)-2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺(表A中的化合物A154)

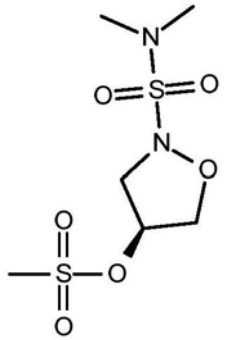
[0665] 

[0666] 将2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺(0.35g)在四氢呋喃(5.5mL)中的溶液在氮气气氛下用环丙基氨磺酰氯(0.161g)处理(按两步获得,通过在0℃下将一当量的氯磺酸加入到三当量在二氯甲烷中的环丙胺中,过滤并且在75℃下用甲苯中的PCl5处理该固体残余物持续2小时,可以通过倾析和蒸发溶剂来回收溶液中的产物。)随后用吡啶处理(0.065g)。在20℃下搅拌一小时之后,将该反应混合物蒸发,并且使该残余物经受硅胶层析法,以产生由NMR表征的标题化合物。

[0667] ^{1}HNMR($CDCl_3$,400MHz):7.75-7.65(m,2H),7.64-7.48(m,1H),7.50(s,2H),7.42(s,1H),7.20(d,1H),5.45-5.35(m,1H),5.11(s,1H),4.48(t,1H),4.21-4.15(m,1H),4.05(d,1H),3.94-3.86(m,1H),3.85-3.76(m,1H),3.68(d,1H),2.73-2-67(m,1H),0.90-0.65(m,4H)。

[0668] 实例6:N-[(4R)-2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺(表A中的化合物A037)

[0669] 步骤A:[(4S)-2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]甲磺酸酯

[0670] 

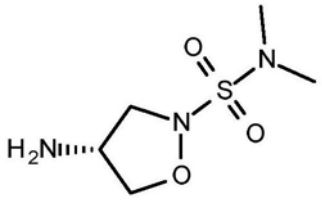
[0671] 在惰性气氛下,向(4S)-异噁唑烷-2-鎓-4-醇氯化物(实例5步骤B中所描述的合成)(5.00g)在四氢呋喃(50mL)中的悬浮液中添加三乙胺(19.6mL)。将该混合物在20℃下搅拌15分钟,然后添加N,N-二甲基胺磺酰氯(4.75mL)。然后,将该反应混合物加热至60℃并且搅拌20小时。

[0672] 然后,将所得悬浮液冷却至0℃,并且滴加甲磺酰氯(3.42mL),这样使得温度保持在30℃以下。然后,将该混合物在20℃下搅拌2小时。将该反应混合物用水(150mL)处理并且

用乙酸乙酯萃取三次。将合并的有机相用碳酸氢钠的饱和水溶液洗涤，随后用盐水洗涤，并经硫酸钠干燥。去除溶剂后，淡棕色油从乙酸乙酯/己烷中结晶，以产生由NMR表征的标题产物的灰白色晶体。

[0673] ^{1}HNMR($CDCl_3$,400MHz):5.67-5.58(m,1H),4.50(dd,J_1=10.4Hz,J_2=6.2Hz,1H),4.24(dd,J_1=10.4Hz,J_2=2.6Hz,1H),4.15(dd,J_1=14.3Hz,J_2=6.2Hz,1H),3.71(dd,J_1=14.3Hz,J_2=2.6Hz,1H),3,10(s,3H),2.96(s,3H)。

[0674] 步骤B然后步骤C:(4R)-4-氨基-N,N-二甲基-异噁唑烷-2-磺酰胺

[0675] 

[0676] 按如合成实例5步骤E和步骤F中所描述的类似方式得到该标题化合物。其由NMR分析进行表征。

[0677] ^{1}HNMR($CDCl_3$,400MHz):4.25(t,1H),4.07-3.99(m,1H),3.79(dd,1H),3.73(dd,1H),3.25(dd,1H),2.89(s,6H)。

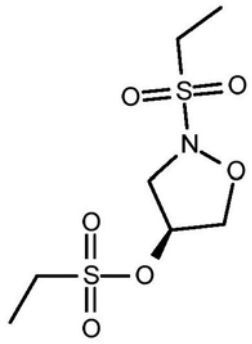
[0678] 步骤D:N-[(4R)-2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺

[0679] 按如先前合成实例中所描述的类似方式，将获得自富立体异构的2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酸的酰基氯与上述(4R)-4-氨基-N,N-二甲基-异噁唑烷-2-磺酰胺进行反应，以产生标题化合物。LC-MS分析(表A中的条件)示出保留时间为1.23分钟以及[M-H]-m/z峰:627、629、631、633。

[0680] ^{1}HNMR($CDCl_3$,400MHz):7.65(s,2H),7.54-7.42(m,3H),7.00(br.d,1H),5.36-5.27(m,1H),4.45(t,1H),4.15(dd,1H),4.07(d,1H),3.87-3.80(m,1H),3.78-3.62(m,2H),2.97(s,6H),2.47(s,3H)。

[0681] 步骤7:4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺(表A中的化合物A121)的合成

[0682] 步骤A:[(4S)-2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-基]乙磺酸盐

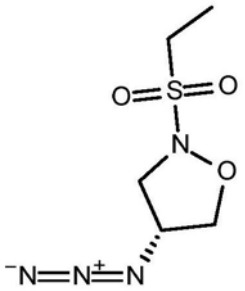
[0683] 

[0684] 在0℃下，向(4S)-异噁唑烷-2-鎓-4-醇氯化物(实例5步骤B中所描述的合成)(2.50g)在二氯甲烷(100mL)中的搅拌悬浮液中添加三乙胺(11.2mL)，由此该反应混合物变成黄色溶液。然后，以使温度不超过25℃的这样一种方式添加乙磺酰氯(6.53g)。形成悬浮液，并且将该反应混合物在0℃下搅拌30min，然后在20℃下搅拌1小时。

[0685] 然后，将该反应混合物用盐酸水溶液(1N)洗涤，随后用水和盐水洗涤。在有机相经硫酸钠干燥并且去除溶剂后，将深棕色油通过硅胶层析纯化，用庚烷和乙酸乙酯的混合物洗脱。分离出呈棕色油状物的标题化合物并且由NMR表征。

[0686] ^{1}HNMR($CDCl_3$,400MHz):5.65-5.59(m,1H),4.47(dd,1H),4.37(dd,1H),4.21(dd,1H),3.72(dd,1H),3.42-3.34(m,2H),3.22(q,2H),1.47-1.38(m,6H)。

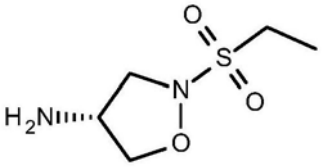
[0687] 步骤B:(4R)-4-叠氮基-2-乙基磺酰基-异噁唑烷

[0688] 

[0689] 以如以上所描述的类似方式，但在90℃下加热，得到呈浅黄色油状的标题化合物。

[0690] ^{1}HNMR($CDCl_3$,400MHz):4.63-4.55(m,1H),4.41(dd,1H),4.21(dd,1H),4.04(dd,1H),3.45-3.20(m,3H),1.44(t,3H)。

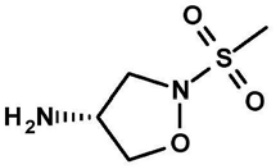
[0691] 步骤C:(4R)-2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-胺

[0692] 

[0693] 以如以上所描述的类似方式，得到呈无色油状的标题化合物。

[0694] ^{1}HNMR($CDCl_3$,400MHz):4.31(dd,1H),4.14-4.06(m,1H),3.90(dd,1H),3.82(dd,1H),3.38-3.25(m,3H),1.60(br.S,2H),1.42(t,3H)。

[0695] 同样，以下还制备呈淡黄色油状物的化合物(4R)-2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-胺

[0696] 

[0697] ^{1}HNMR($CDCl_3$,400MHz):4.34(dd,1H),4.13-4.07(m,1H),3.88(dd,1H),3.84(dd,1H),3.34(dd,1H),3.12(s,3H),1.56(br.s,2H)。

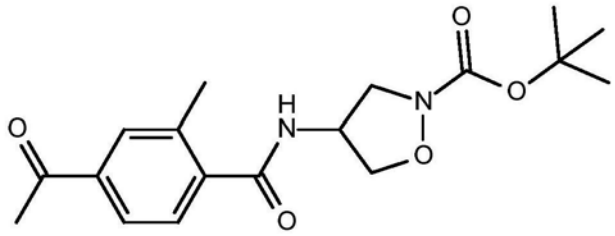
[0698] 步骤D:4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺

[0699] 在获得自富立体异构的4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酸的酰基氯与(4R)-2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-胺反应之后，以如先前合成实例中所描述的类似方式获得该标题化合物。

[0700] ^{1}HNMR($CDCl_3$,400MHz):7.53-7.47(m,4H),7.46-7.41(m,2H),6.95(d,1H),5.36-5.28(m,1H),4.50-4.43(m,1H),4.18-4.13(m,1H),4.08(d,1H),3.98(d,1H),3.72-3.64(m,2H),3.45-3.23(m,2H),2.47(s,3H),1.43(t,3H)。

[0701] 实例8:4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺

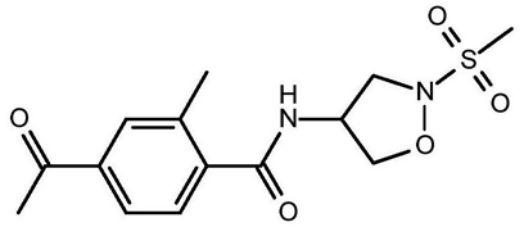
[0702] 步骤A:4-[(4-乙酰基-2-甲基-苯甲酰基)氨基]异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯

[0703] 

[0704] 按与实例1步骤A类似的方式,用4-氨基异噁唑烷-2-羧酸叔丁酯处理4-乙酰基-2-甲基-苯甲酰氯导致呈粘性油状物的标题产物。

[0705] ^{1}HNMR($CDCl_3$,400MHz):7.76(s,1H),7.72(d,2H),7.39(d,1H),6.58(br.d,1H),5.05-4.96(m,1H),4.10-4.02(m,2H),3.97(dd,1H),3.60(dd,1H),2.58(s,3H),2.45(s,3H),1.47(s,9H)。

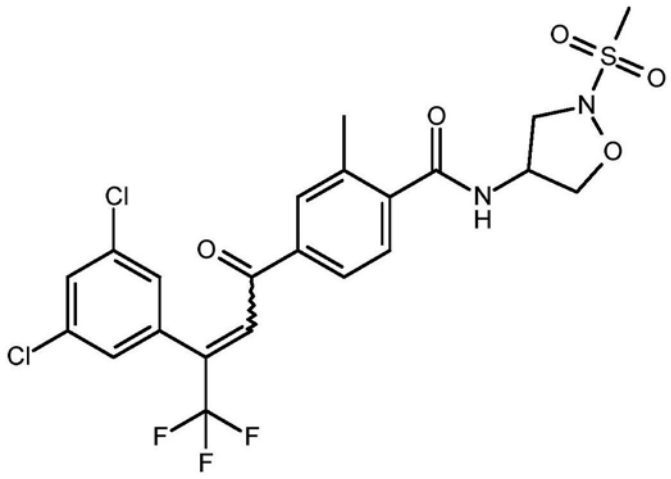
[0706] 步骤B:4-乙酰基-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺

[0707] 

[0708] 按与实例1步骤B和步骤C类似的方式进行,但使用甲磺酰氯代替环丁基磺酰氯,得到呈无色晶体状的标题化合物,其熔点为153-155℃。

[0709] ^{1}HNMR($CDCl_3$,400MHz):7.80-7.73(m,2H),7.44(d,1H),6.94(br.d,1H),5.37-5.29(m,1H),4.48(t,1H),4.18(dd,1H),3.96(d,1H),3.71(dd,1H),3.17(s,3H),2.60(s,3H),2.48(s,3H)。

[0710] 步骤C:4-[(E-Z)-3-(3,5-二氯苯基)-4,4,4-三氟-丁-2-烯酰基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺

[0711] 

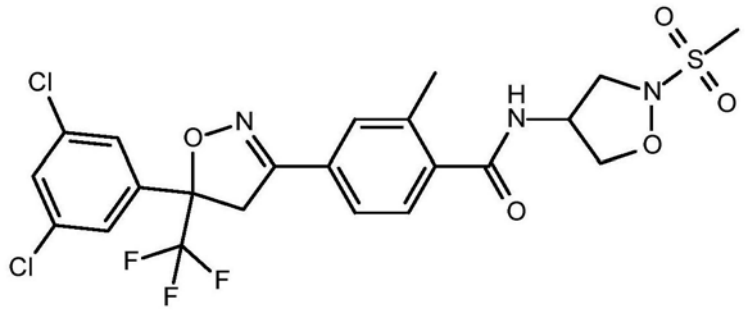
[0712] 将4-乙酰基-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺(3.00g)、1-(3,5-二氯苯基)-2,2,2-三氟-乙酮(3.35g)以及碳酸钾(3.18g)在四氢呋喃(50mL)中混合。将

该悬浮液在65℃搅拌44小时。

[0713] 将得到的混合物用水(200mL)和2N盐酸(25mL)稀释，然后用乙酸乙酯萃取两次。将该有机相用水、用盐水洗涤并且经硫酸钠干燥。在蒸发溶剂之后，使该粗产物经受硅胶层析法。

[0714] ^{1}HNMR($CDCl_3$,400MHz):7.68-7.63(m,2H),7.45(d,1H),7.35(d,1H),7.14(s,2H),6.90(br.d,1H),5.38-5.28(m,1H),4.50(t,1H),4.20(dd,1H),4.01-3.95(m,1H),3.68(dd,1H),3.18(s,3H),2.48(s,3H)。

[0715] 步骤D:4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺

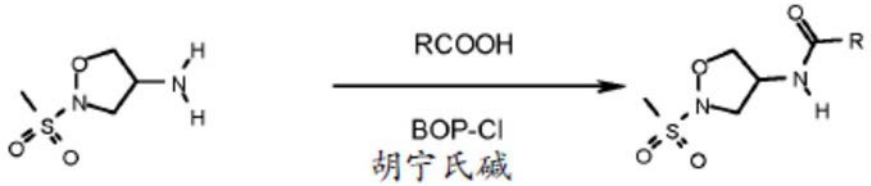
[0716] 

[0717] 向在-20℃下在氮气气氛下搅拌的4-[(E-Z)-3-(3,5-二氯苯基)-4,4,4-三氟-丁-2-烯酰基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺(3.15g)在氯仿(57mL)中的搅拌溶液中加入氢氧化铯水合物(2.89g)在水(3mL)中的溶液，随后加入羟胺(0.76g)的50％水溶液以及(R)-[1-(9-蒽基甲基)-5-乙烯基-奎宁环-1-鎓-2-基]-(6-甲氧基-4-喹啉基)甲醇氯化物(0.63g)。(0.2当量)。在该温度下3小时之后，去除浴并且将该混合物在20℃下搅拌15小时。

[0718] 将该反应混合物用二氯甲烷(50ml)稀释，然后用稀释的HCl洗涤。因为很难相分离，用水性氢氧化钠处理该混合物至pH 11。将有机层用硫酸钠干燥并且浓缩。使该残余物经受硅胶层析法，以产生由NMR表征的标题产物。

[0719] ^{1}HNMR($CDCl_3$,400MHz):7.54-7.47(m,4H),7.46-7.39(m,2H),6.91(br.d,1H),5.35-5.27(m,1H),4.50-4.48(t,1H),4.20-4.14(m,1H),4.14-4.04(m,1H),3.95(d,1H),3.75-3.66(m,2H),3.17(s,3H),2.47(s,3H)

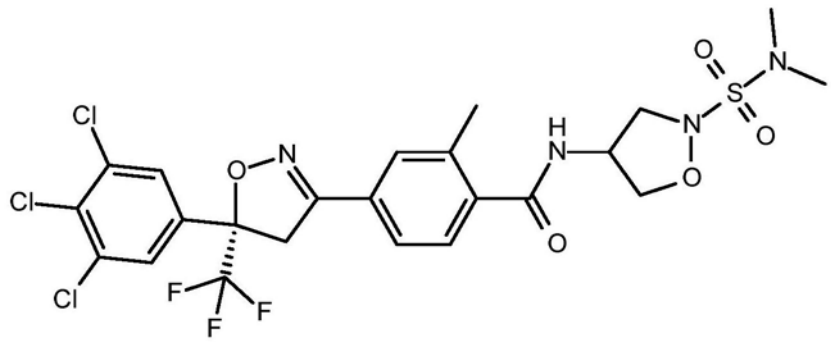
[0720] 实例9:用于从羧酸制备本发明的化合物的方法

[0721] 

[0722] 向具有式RCOOH的酸(45μmol)，例如在表AX的化合物编号A040的情况下的4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酸在二甲基乙酰胺(0.3ml)中的溶液中，依次加入2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-胺(30μmol)在二甲基乙酰胺(0.25ml)中的溶液、二异丙基乙基胺(胡宁氏碱)(0.6ml)以及双(2-氧代-3-噁唑烷基)膦酰氯(“BOP-Cl”)(15.3mg)在二甲基乙酰胺(0.25ml)中的溶液。将反应混合物在50℃下搅拌16小时。然后，将该反应混合物蒸发至干燥。将剩余的混合物用甲醇/二甲基乙酰胺(4:1)

(0.7ml)溶解并且通过制备型HPLC纯化。使用这种方法平行地制备了多种化合物(表A的化合物编号A040以及A045至A066)。

[0723] 实例10:4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺(表A中的实例A037和A112)的拆分

[0724] 

[0725] 在下述条件下,使N-[2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺的异构体的混合物通过手性HPLC经受制备性分离。

[0726] 分析型HPLC方法:

[0727] HPLC:沃特斯UPLC-HClass,DAD检测器沃特斯UPLC

[0728] 柱:Daicel CHIRALPAK® IF,3μm,0.46cm×10cm

[0729] 流动相:Hept/EtOAc 70/30

[0730] 流速:1.0ml/min

[0731] 检测:265nm

[0732] 样品浓度:1mg/mL,在DCM/iPrOH 50/50中

[0733] 注射:2μl

[0734] 制备型HPLC方法:

[0735] 来自沃特斯的自动纯化系统:2767样品管理器,2489紫外/可见检测器,2545四元梯度模块。

[0736] 柱:Daicel CHIRALPAK® IF,5μm,1.0cm×25cm

[0737] 流动相:Hept/EtOAc 70/30

[0738] 流速:10ml/min

[0739] 检测:UV 260nm

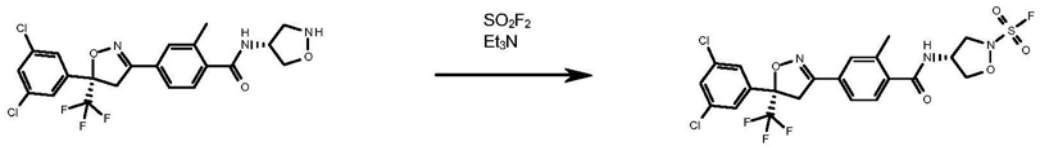
[0740] 样品浓度:166mg/mL,在EtOAc/Hept中,经过滤

[0741] 注射:30μl-150μl

[0742]

第一洗脱对映异构体(表A中的化合物A112)	第二洗脱对映异构体(表A中的化合物A037)
保留时间(min) 约5.45	保留时间(min) 约8.86
化学纯度(在265 nm处的面积%) 99	化学纯度(在265 nm处的面积%) 99
对映异构体过量(%) >99	对映异构体过量(%) >99

[0743] 实例11:(4R)-4-[[4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酰基]氨基]异噁唑烷-2-磺酰氟(表A中的化合物A198)

[0744] 

[0745] 向1.000g的化合物4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺(如同样在实例5步骤G中所得到的)在四氢呋喃(15ml)中的溶液中添加三乙胺(0.207g)。将缓慢的氟化硫酰气流以鼓泡的方式通过该混合物持续一小时,然后在20℃下将该混合物搅拌过夜。然后在真空下浓缩该反应混合物。将该残余物溶解于乙酸乙酯中并且用水洗涤,用硫酸钠干燥,并且将该粗产物通过硅胶层析法纯化,用乙酸乙酯和庚烷的混合物洗脱。

[0746] 该标题化合物由LC-MS(参见表A)和NMR表征。

[0747] ^{1}HNMR($CDCl_3$,400MHz):7.50(s,2H),7.48-7.39(m,3H),7.38-7.32(m,1H),6.75-6.60(m,1H),5.28-5.18(m,1H),4.47-4.40(m,1H),4.20(d,1H),4.18-4.05(m,2H),3.84(d,1H),3.71(d,1H),2.40(s,3H)

[0748] 表A:根据本发明的化合物

[0749]

化合物编号	化学名称	LC-MS方法	RT (min)	$[M+H]^+$	[M-H]-
A1	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-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	A	1.14	584 / 586 / 588	
A2	N-[2-(4-氯苯基)磺酰基异噁唑烷-4-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	A	1.26	678 / 680 / 682 / 684	
A3	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-N-(2-丙基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	A	1.21	612 / 614 / 616	
A4	4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-(2-乙基磺酰基异噁	A	1.18	598 / 600 / 602	

[0750]

	唑烷-4-基)-2-甲基-苯甲酰胺				
A5	N-[2-(氯甲基磺酰基)异噁唑烷-4-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	A	1.18	618 / 620 / 622 / 624	
A6	N-(2-环丙基磺酰基异噁唑烷-4-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	A	1.18	610 / 612 / 614	
A7	N-[2-(2-氯乙基磺酰基)异噁唑烷-4-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	A	1.17	632 / 634 / 636 / 638	
A8	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-N-[2-(2,2,2-三氟乙基磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.2	652 / 654 / 656	
A9	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-N-[2-(2-噻吩基磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.19	652 / 654 / 656	
A10	4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.19	613 / 615 / 617	
A11	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-N-[2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.22	666 / 668 / 670	
A12	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-N-[(4S)-2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.14	584 / 586 / 588	
A13	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-N-[(4R)-2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.14	584 / 586 / 588	
A14	N-(2-环丁基磺酰基异噁唑烷-4-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	A	1.22	624 / 626 / 628	
A15	2-氯-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.17	620 / 622 / 624 / 626	
A16	4-[(5S)-5-[3-溴-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	A	1.14	644 / 646	
A17	4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-(2-异丙基磺酰基异	A	1.21	612 / 614 / 616	

[0751]

	噁唑烷-4-基)-2-甲基-苯甲酰胺				
A18	4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[2-(2-甲氧基乙基磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.17	628 / 630 / 632	
A19	2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	A	1.15		602 / 604 / 606 / 608
A20	4-[(5S)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	A	1.14	600 / 602	
A21	2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.18	633 / 635 / 637	
A22	4-[(5S)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.17	629 / 631	
A23	4-[(5S)-5-[3-溴-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.18	673 / 675	
A24	2-氯-N-(2-环丙基磺酰基异噁唑烷-4-基)-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-苯甲酰胺	A	1.18	630 / 632 / 634 / 636	
A25	2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-(2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	A	1.2	618 / 620 / 622 / 624	
A26	2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.18		598 / 600 / 602
A27	N-(2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-基)-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.2	614 / 616 / 618 / 620	
A28	2-氯-N-(2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-基)-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.22	634 / 636 / 638 / 640 / 642	
A29	N-(2-环丙基磺酰基异噁唑烷-4-基)-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.21	626 / 628 / 630 / 632	
A30	2-氯-N-(2-环丙基磺酰基异噁唑烷-4-基)-4-	A	1.22	646 / 648 / 650 / 652	

[0752]

	[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺				
A31	N-[2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.22	629 / 631 / 633 / 635	
A32	2-氯-N-[2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.23	649 / 651 / 653 / 655	
A33	4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	A	1.14		564 / 565 / 568
A34	4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4S)-2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.19	613 / 615 / 617	
A35	2-甲基-N-(2-氨磺酰基异噁唑烷-4-基)-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.13	601 / 603 / 605	
A36	2-甲基-N-[(4R)-2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.18	600 / 602 / 604	
A37	N-[(4R)-2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.23		627 / 629 / 631 / 633
A38	4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4R)-2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.14	566 / 568	
A39	4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.19	595 / 597	
A40	4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	D	1.89	566.13	
A41	4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	B	1.17		593 / 595
A42	4-[(5S)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-(2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-基)-2-甲基-苯甲酰胺	B	1.17		612 / 614

[0753]

A43	2-溴-N-(2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-基)-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	B	1.22		676 / 678 / 680
A44	2-溴-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-(2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	B	1.19		660 / 662 / 664
A45	4-[5-(4-溴-3,5-二氯-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	D	1.98	644.01	
A46	4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)萘-1-甲酰胺	D	1.97	602.11	
A47	2-氰基-4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	D	1.9	577.09	
A48	2-溴-4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	D	1.89	630	
A49	2-氯-4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	D	1.88	586.05	
A50	4-[5-(3,5-二氯-4-氰基-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	D	1.76	591.09	
A51	4-[5-(3-氯-5-甲基-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	D	1.81	546.16	
A52	2-环丙基-4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	D	1.93	592.13	
A53	2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)-4-[5-[4-(三氟甲氧基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	D	1.79	582.16	
A54	4-[5-(2-氟-4-吡啶基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	D	1.44	517.15	
A55	4-[5-(4-溴苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	D	1.74	576.1	

[0754]

A56	8-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)喹啉-5-甲酰胺	D	1.93	603.09	
A57	4-[5-[4-氯-3,5-双(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	D	2	668.1	
A58	4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)-2-(三氟甲基)苯甲酰胺	D	1.93	620.07	
A59	4-[5-[3,5-双(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	D	1.91	634.15	
A60	2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)-4-[5-(三氟甲基)-5-[3-(三氟甲基)苯基]-4H-异噁唑-3-基]甲酰胺	D	1.74	566.17	
A61	2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)-4-[5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	D	1.97	600.06	
A62	4-[5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	D	1.89	600.12	
A63	4-[5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	D	1.89	584.11	
A64	4-[5-[氯(二氟)甲基]-5-(3,5-二氯苯基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	D	1.91	582.08	
A65	4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)-2-乙烯基-苯甲酰胺	D	1.91	578.12	
A66	4-[5-(3,4-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	D	1.83	566.13	
A67	2-甲基-N-[(4R)-2-(甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.17		615 / 617 / 619
A68	2-甲基-N-[(4R)-2-氨磺酰基异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.13		599 / 601 / 603

	A69	2-甲基-N-[2-(甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.18		613 / 615 / 617
	A70	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-N-[2-(甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.14	599 / 601 / 603	
	A71	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-N-(2-氨磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	A	1.1	585 / 587 / 589	
	A72	N-[(4R)-2-[乙基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.25		641 / 643 / 645
	A73	N-[2-[乙基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.25		641 / 643 / 645
	A74	4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[2-[二甲基氨基甲酰基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.16	670 / 672 / 674	
[0755]	A75	4-[(5S)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4R)-2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.14		598 / 600
	A76	N-[4-[[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]异噁唑烷-2-基]磺酰基-N-甲基-氨基甲酸乙酯	A	1.21	671 / 673	
	A77	N-[4-[[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]异噁唑烷-2-基]磺酰基-N-甲基-氨基甲酸甲酯	A	1.18		655 / 657 / 659
	A78	N-[4-[[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]异噁唑烷-2-基]磺酰基-N-甲基-吡啶-3-甲酰胺	A	1.18	704 / 706 / 708	
	A79	4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[2-[二甲基氨磺酰基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.2		704 / 706 / 708
	A80	N-[2-[苯甲酰基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-	A	1.24		701 /

	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				703 / 705
A81	N-[2-[氟基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-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	A	1.18		622 / 624 / 626
A82	N-[2-[烯丙基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.27		653 / 655 / 656
A83	2-甲基-N-[2-[甲基(环氧乙烷-2-基甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.21		669 / 671 / 674
A84	2-甲基-N-[2-[甲基(丙基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.28		655 / 657 / 659
A85	N-[2-[丁基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.31		669 / 671 / 673
A86	N-[2-[苄基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.31		703 / 706 / 707
A87	N-[2-[氟基甲基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.2		652 / 654 / 656
A88	2-[甲基-[4-[[2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰基]氨基]异噁唑烷-2-基]磺酰基-氨基]乙酸甲酯	A	1.21		*[M+HCOO]- 721 / 723 / 725
A89	2-[甲基-[4-[[2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰基]氨基]异噁唑烷-2-基]磺酰基-氨基]乙酸乙酯	A	1.24		699 / 701 / 703
A90	N-[2-[2-甲氧基乙基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.23		671 / 673 / 676
A91	4-[(5S)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.19	629 / 631	

[0756]

[0757]

A92	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-N-[2-[甲基(甲基磺酰基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.17	677 / 679 / 701	
A93	N-[4-[[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]异噁唑烷-2-基]磺酰基-N-乙基-氨基甲酸叔丁酯	A	1.28		712 / 714 / 716
A94	N-烯丙基-N-[4-[[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]异噁唑烷-2-基]磺酰基-氨基甲酸叔丁酯	A	1.28		723 / 725 / 727
A95	4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[2-(乙基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.15	613 / 615 / 617	
A96	N-[2-[甲氧基甲基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.22		657 / 659
A97	N-[2-(叔丁基氨磺酰基)异噁唑烷-4-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	A	1.19		641 / 643
A98	4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[2-(二乙基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.23		639 / 641 / 643
A99	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-N-(2-吡咯烷-1-基磺酰基异噁唑烷-4-基)苯甲酰胺	A	1.2		639 / 641 / 643
A100	N-[2-[叔丁基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-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	A	1.25		655 / 657 / 659
A101	N-[2-(异丙基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.2		641 / 643 / 645
A102	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-N-[2-(甲基磺酰基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.01		661 / 663 / 665
A103	N-[2-[异丙基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.26		655 / 657 / 659

[0758]

A104	N-[2-[乙基(异丙基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.29	671 / 673 / 675	
A105	N-[2-(烯丙基氨磺酰基)异噁唑烷-4-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	A	1.15	625 / 627 / 629	
A106	4-[[2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰基]氨基]异噁唑烷-2-磺酰氟	A	1.25		602 / 604 / 606
A107	2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.24	633 / 635 / 637	
A108	2-氯-4-[(5S)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.23		647 / 649
A109	2-氯-N-[(4R)-2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.23	649 / 651 / 653 / 655	
A110	2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.19		613 / 615 / 617
A111	N-[(4R)-2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(三氟甲基)-5-[3-(三氟甲基)苯基]-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.12	595	
A112	N-[(4S)-2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	*	*	*	*
A113	2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(乙基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.21	615 / 617 / 619	613 / 615 / 617
A114	2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.18	601 / 603 / 605	599 / 601 / 603
A115	2-氯-4-[(5S)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.19	635 / 637 / 639	633 / 635 / 637
A116	2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.19	586 / 588 / 590	

[0759]

A117	2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.22	600 / 602 / 604	
A118	N-[(4R)-2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.22	614 / 616 / 618	
A119	4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.18	598 / 600 / 602	
A120	4-[(5S)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.18		612 / 614 / 616
A121	4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.17	580 / 582 / 584	
A122	2-氯-4-[(5S)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.18	634 / 636	
A123	2-氯-4-[(5S)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.15	620 / 622	
A124	2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(乙基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	C	2.05	633 / 635 / 637	631 / 633 / 635
A125	2-氯-N-[(4R)-2-(乙基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	C	2.13	649 / 651 / 653 / 655	647 / 649 / 651 / 653
A126	2-氯-N-[(4R)-2-(甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	C	2.07	635 / 637 / 639 / 641	633 / 635 / 637
A127	2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.27	629 / 631 / 633	627 / 629 / 631
A128	2-氯-4-[(5S)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(乙基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.21	649 / 651 / 653	647 / 649
A129	2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-[乙基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.27	629 / 631 / 633	627 / 629 / 631

[0760]

A130	2-氯-4-[(5S)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-[乙基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.27	663 / 665	661 / 663 / 665
A131	2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-[乙基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	C	2.18	647 / 649 / 651	645 / 647 / 649
A132	2-氯-N-[(4R)-2-[乙基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	C	2.26	663 / 665 / 667	661 / 663 / 665 / 667
A133	4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(乙基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.2		611 / 613 / 615
A134	4-[(5S)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(乙基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.2		627 / 629
A135	4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(乙基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.2		593 / 595 / 597
A136	N-[(4R)-2-(乙基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.24		627 / 629 / 631
A137	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-N-[(4R)-2-(甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.19		597 / 599 / 601
A138	4-[(5S)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4R)-2-(甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.18		613 / 615
A139	4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4R)-2-(甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.18		579 / 581 / 583
A140	4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-[乙基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.26		625 / 627 / 629
A141	4-[(5S)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-[乙基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.26		641 / 643
A142	4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-[乙基(甲基)氨磺酰	A	1.26		607 / 609

[0761]

	基]异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺				
A143	4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(二甲基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.23	613 / 615	
A144	2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.16	604 / 606 / 608 / 610	
A145	2-氯-N-[(4R)-2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.19	620 / 622 / 624	
A146	2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.23	618 / 620 / 622	
A147	2-氯-N-[(4R)-2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.27		632 / 634 / 636
A148	N-[(4R)-2-(氮杂环丁烷-1-基磺酰基)异噁唑烷-4-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	A	1.26		623 / 625
A149	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-N-[(4R)-2-(2,2,2-三氟乙基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.25		665 / 667 / 669
A150	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-N-[(4R)-2-[甲基(2,2,2-三氟乙基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.25		679 / 681 / 683
A151	N-[(4R)-4-[[2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰基]氨基]异噁唑烷-2-基]磺酰基氨基甲酸叔丁酯	A	1.19		685 / 687 / 687
A152	N-[(4R)-4-[[2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰基]氨基]异噁唑烷-2-基]磺酰基-N-丙-2-炔基-氨基甲酸叔丁酯	A	1.28		723 / 725
A153	2-氯-N-[(4R)-2-[环丙基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.23	641 / 643 / 645	
A154	2-氯-N-[(4R)-2-(环丙基氨磺酰基)异噁唑烷-	A	1.17	627 / 629 /	

[0762]

	4-基]-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺			631	
A155	N-[(4R)-2-(环丙基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.16	607 / 609.611	
A156	N-[(4R)-2-[环丙基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-苯甲酰胺	A	1.23	621 / 623	
A157	2-氯-N-[(4R)-2-[环丙基(乙基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.26	655 / 657 / 659	
A158	2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(丙-2-炔基氨磺酰基)异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.15	625 / 627 / 629	
A159	2-甲基-N-[(4R)-2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(三氟甲基)-5-[3-(三氟甲基)苯基]-4H-异噁唑-3-基]甲酰胺	A	1.07		564
A160	N-[(4R)-2-乙基磺酰基异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(三氟甲基)-5-[3-(三氟甲基)苯基]-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.11	580	
A161	2-氯-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-[乙基(丙-2-炔基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.23	653 / 655 / 657 / 659	
A162	N-[2-[乙酰基(甲基)氨磺酰基]异噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.2	641 / 643	
A163	N-[(4R)-2-(氯基甲基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5R)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.17	609、611	
A164	N-[(4R)-2-(氯甲基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5R)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.21	618、620、622	
A165	N-[(4R)-2-(氯基甲基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5R)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.16		589、591、593
A166	N-[(4R)-2-(氯甲基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5R)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.19	600、602、604	
A167	N-[(4R)-2-[(1-氯基环丙基)氨磺酰基]-1,2-噁	A	1.15	632、634	

[0763]

	唑烷-4-基]-4-[(5R)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰胺				
A168	N-[(4R)-2-[(1-氰基环丙基)氨磺酰基]-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5R)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.16	650、652	
A169	N-[(4S)-2-(二甲基氨磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-[3-氟-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.19	613	
A170	4-[(5S)-5-[3-氟-4-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4R)-2-甲基磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.13	584	
A171	N-[(4S)-2-(二甲基氨磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5R)-5-[3-氟-4-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.18	613	
A172	4-[(5S)-5-[3-氟-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4S)-2-甲基磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.14	584	
A173	N-[(4S)-2-(溴甲基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.20	644、646、648	
A174	2-[[(4S)-4-[[4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰基]氨基]-1,2-噁唑烷-2-基]磺酰基]乙酸	A	1.10	610、612、614	
A175	4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-N-[(4S)-2-乙烯基磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.17	578、580	
A176	2-[[(4R)-4-[[4-[(5R)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰基]氨基]-1,2-噁唑烷-2-基]磺酰基]乙酸甲酯	A	1.16	624、628、630	
A177	N-[(4R)-2-(2-溴乙基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5R)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.22		656、658、660
A178	4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4S)-2-氨磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.09	567、569、571	
A179	N-[(4R)-2-[(1-氰基环丙基)-甲基氨磺酰基]-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5R)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲	A	1.20	645、647、649	

[0764]

	酰胺				
A180	4-[(5R)-5-[3-氟-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4R)-2-(甲基氨磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.10	599	
A181	4-[(5S)-5-[4-氟-3-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4S)-2-(甲基氨磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.09	599	
A182	4-[(5S)-5-[3-氟-4-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4S)-2-(甲基氨磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.10	599	
A183	4-[(5S)-5-[4-氟-3-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4R)-2-甲基磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.10	584	
A184	N-[(4S)-2-(二甲基氨磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5R)-5-[4-氟-3-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.15	613	
A185	4-[(5R)-5-[3-氯-5-(二氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4R)-2-甲基磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	B	1.09	582、584	
A186	4-[(5R)-5-[3-氯-5-(二氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(二甲基氨磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-2-甲基苯甲酰胺	B	1.14	611、613	
A187	N-[(4S)-2-[(1-氰基环丙基)-甲基氨磺酰基]-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.22	664、666	
A188	4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4S)-2-吗啉-4-基磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.20	655、657、659	
A189	N-[(4R)-2-(溴甲基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.20	662、664、666	
A190	2-[[(4S)-4-[[4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰基]氨基]-1,2-噁唑烷-2-基]磺酰基]乙酸甲酯	A	1.17	642、644、646	
A191	N-[(4R)-2-(2-溴乙基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5R)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲	A	1.23	676、678、680	

[0765]

	基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰胺				
A192	4-[(5R)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4R)-2-(2,2,2-三氟乙基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.22	652、654、656	
A193	4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-乙烯基磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.18	596、598、600	
A194	4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4S)-2-(2,2,2-三氟乙基氨磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.19	649、651	
A195	4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4S)-2-(2,2,2-三氟乙基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.22	634、636、638	
A196	4-[(5S)-5-[3,5-二氯-4-(二氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-N-[(4S)-2-(二甲基氨磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.19	645、647、649	
A197	4-[(5S)-5-[3,5-二氯-4-(二氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4S)-2-甲基磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.13	616、618、620	
A198	(4R)-4-[[4-[(5R)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰基]氨基]-1,2-噁唑烷-2-磺酰氟	A	1.23	570、572、574	
A199	4-[(5R)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4R)-2-(3,3,3-三氟丙基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.24	666、668、670	
A200	2-[[(4S)-4-[[4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰基]氨基]-1,2-噁唑烷-2-基]磺酰基]乙酸	A	1.10	628、630	
A201	4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4S)-2-[2-(甲基氨基)-2-氧代乙基]磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.10	623、625	
A202	4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-N-[(4S)-2-[2-(二甲基氨基)-2-氧代乙基]磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.12	637、639、641	
A203	4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-N-[(4S)-2-[2-(羟氨基)-2-	C	1.79	643、645、647	

[0766]

	氧代乙基]磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]-2-甲基苯甲酰胺				
A204	4-[(5S)-5-[3,5-二氯-4-(二氟甲氧基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4S)-2-甲基磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.13	632、634、636	
A205	4-[(5S)-5-[3,5-二氯-4-(二氟甲氧基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-N-[(4S)-2-(二甲基氨磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.18	661、663、665	
A206	4-[(5R)-5-[3,5-二氯-4-(二氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4R)-2-(甲基氨磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.12	631、633、635	
A207	4-[(5R)-5-[3,5-二氯-4-(二氟甲氧基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4R)-2-(甲基氨磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.12	647、649、651	
A208	4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4S)-2-氨磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.10	585、587、589	
A209	N-[[(4R)-4-[[4-[(5R)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰基]氨基]-1,2-噁唑烷-2-基]磺酰基]氨基甲酸叔丁酯	A	1.21		683、685、687
A210	4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-N-[(4S)-2-(氟甲基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.17	583、586	
A211	4-[(5R)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(氟甲基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.19	602、604	
A212	2-甲基-N-[(4S)-2-甲基磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5R)-5-[3-甲基-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]苯甲酰胺	C	1.91	580	
A213	(4S)-4-[[4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰基]氨基]-1,2-噁唑烷-2-磺酰氟	A	1.22	588、590、592	
A214	4-[(5S)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4S)-2-	A	1.23	668、670	

[0767]

	(2,2,2-三氟乙基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺				
A215	2-甲基-N-[(4R)-2-甲基磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(三氟甲基)-5-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]-4H-1,2-噁唑-3-基]苯甲酰胺	C	1.70	567	
A216	N-[(4R)-2-(氟甲基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5R)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.23	618、620、622	
A217	N-[(4R)-2-(氟甲基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5R)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.20	634、636	
A218	4-[(5R)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(氟甲基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.19	618、620	
A219	(4R)-4-[[4-[(5R)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰基]氨基]-1,2-噁唑烷-2-磺酰氟	A	1.23	604、606	
A220	N-[(4R)-2-(氟甲基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5R)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.25	634、636、638	
A221	2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(2,2,2-三氟乙基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.27	668、670、672	
A222	2-甲基-N-[(4R)-2-甲基磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[5-(三氟甲基)-5-[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]-4H-1,2-噁唑-3-基]苯甲酰胺	C	1.71	567	
A223	4-[(5R)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4S)-2-(三氟甲基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.26	638、640、642	
A224	4-[(5R)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4S)-2-(三氟甲基硫烷基)-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺	A	1.26	606、608、610	
A225	4-[(5R)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(2,2-二氟乙基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.20	634、636、638	
A226	4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-N-[(4R)-2-(二氟甲基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.21	620、622、624	
A227	4-[(5R)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-	A	1.31	654、	

[0768]

	4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-[(4R)-2-(三氟甲基硫烷基)-1,2-噁唑烷-4-基]苯甲酰胺			656、658、660、662	
A228	N-[(4S)-2-环丙基磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.19	610、612、614	
A229	N-[(4S)-2-环丙基磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.24	626、628、630	
A230	N-[(4S)-2-环丙基磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.19	592、594	
A231	N-[(4R)-2-(二氟甲基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-2-甲基-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.24	636、638、640	
A232	4-[(5R)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-N-[(4S)-2-(二氟甲基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.20	602、604、606	
A233	4-[(5S)-5-[3-氯-5-(三氟甲基)苯基]-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-N-[(4S)-2-(二氟甲基磺酰基)-1,2-噁唑烷-4-基]-2-甲基苯甲酰胺	A	1.20	636、638	
A234	N-[[(4R)-4-[[4-[(5R)-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基苯甲酰基]氨基]-1,2-噁唑烷-2-基]磺酰基]氨基甲酸叔丁酯	A	1.20		665、667、669
A235	2-甲基-N-[(4S)-2-(1-甲基环丙基)磺酰基-1,2-噁唑烷-4-基]-4-[(5S)-5-(3,4,5-三氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-1,2-噁唑-3-基]苯甲酰胺	A	1.27	640、642、644	
A236	6-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-4-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)吡啶-3-甲酰胺	D	1.83	567.1	
A237	6-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-2-甲基-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)吡啶-3-甲酰胺	D	1.86	567.12	
A238	5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)吡啶-2-甲酰胺	D	1.85	553.09	

[0769]

A239	1-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-(2-甲基磺酰基异噁唑烷-4-基)异喹啉-4-甲酰胺	D	2	603.11	

[0770] 生物学实例

[0771] 这些实例展示了具有式(I)的化合物的杀有害生物/杀虫特性。

[0772] 进行了如下试验：

[0773] 黄瓜条叶甲(玉米根虫)

[0774] 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。

[0775] 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：

[0776] A1、A2、A3、A4、A5、A6、A7、A8、A9、A10、A11、A12、A13、A14、A15、A16、A17、A18、A19、A20、A21、A22、A23、A24、A25、A27、A28、A29、A30、A31、A32、A33、A34、A35、A36、A37、A38、A39、A40、A41、A42、A43、A44、A45、A46、A48、A49、A50、A51、A52、A53、A54、A55、A57、A58、A59、A60、A61、A62、A63、A64、A65、A66、A67、A68、A69、A70、A71、A72、A73、A74、A75、A76、A77、A78、A79、A80、A81、A82、A83、A84、A85、A86、A87、A88、A89、A90、A91、A92、A93、A94、A95、A96、A97、A98、A99、A100、A101、A102、A103、A104、A105、A106、A107、A108、A109、A110、A111、A112、A113、A114、A115、A116、A117、A118、A119、A120、A121、A122、A123、A124、A125、A126、A127、A128、A129、A130、A131、A132、A133、A134、A135、A136、A137、A138、A139、A140、A141、A142、A143、A144、A145、A146、A147、A148、A149、A150、A151、A152、A153、A154、A155、A156、A157、A158、A159、A160、A161、A162、A163、A164、A165、A166、A167、A168、A169、A170、A171、A172、A173、A174、A176、A178、A179、A180、A181、A182、A183、A184、A185、A186、A187、A188、A189、A190、A192、A194、A195、A196、A197、A198、A199、A200、A201、A202、A203、A204、A205、A206、A207、A208、A209、A210、A211、A212、A213、A214、A215、A216、A217、A218、A219、A220、A221、A222、A223、A224、A225、A226、A227、A228、A229、A230、A231、A232、A233、A236、A237、A239。

[0777] 英雄美洲蝉(新热带区褐蝉象)

[0778] 将24孔微量滴定板中的琼脂上的大豆叶片用从10'000ppm DMSO储备溶液中制备的水性测试溶液进行喷雾。在干燥之后，用N2期若虫对叶片进行侵染。侵染5天之后，相比于未处理样品，针对死亡率和生长抑制对这些样品进行评估。

[0779] 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：

[0780] A2、A3、A4、A5、A6、A7、A8、A9、A10、A11、A12、A13、A14、A15、A17、A18、A19、A20、A26、A27、A33、A34、A35、A36、A37、A38、A39、A40、A41、A42、A43、A44、A45、A46、A48、A49、A50、A52、A54、A57、A58、A59、A60、A61、A62、A63、A64、A65、A66、A67、A68、A69、A70、A71、A72、A73、A74、A75、A76、A77、A78、A79、A80、A81、A82、A83、A84、A85、A86、A87、A88、A89、A90、A91、A92、A93、A94、A95、A96、A97、A98、A99、A100、A101、A102、A103、A104、A105、A106、A107、A108、A109、A110、A111、A112、A113、A114、A115、A116、A117、A118、A119、A120、A121、A122、A123、A124、A125、A126、A127、A128、A129、A130、A131、A132、A133、A134、A135、A136、A137、A138、A139、

A140、A141、A142、A143、A144、A145、A146、A147、A148、A149、A150、A151、A152、A153、A154、A155、A156、A157、A158、A159、A160、A161、A162、A163、A164、A165、A166、A167、A168、A169、A172、A173、A174、A176、A178、A179、A180、A181、A183、A184、A185、A186、A187、A188、A189、A190、A192、A194、A195、A196、A197、A198、A199、A200、A201、A202、A203、A204、A205、A206、A207、A209、A210、A211、A212、A213、A214、A215、A216、A217、A218、A219、A220、A221、A223、A224、A225、A226、A227、A228、A229、A230、A231、A232、A233、A236、A239

[0781] 桃蚜(绿色桃蚜虫):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蚜虫群体进行侵染。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] A1、A3、A4、A5、A6、A7、A10、A11、A12、A13、A14、A15、A16、A17、A18、A19、A20、A21、A22、A23、A24、A25、A27、A28、A29、A30、A31、A32、A33、A34、A35、A36、A37、A38、A39、A40、A41、A42、A43、A44、A45、A50、A59、A61、A62、A63、A64、A65、A66、A67、A68、A69、A70、A71、A72、A73、A74、A75、A76、A77、A78、A79、A80、A81、A82、A83、A84、A85、A86、A87、A90、A91、A93、A95、A96、A97、A98、A99、A100、A101、A103、A104、A105、A106、A107、A108、A109、A111、A112、A113、A114、A115、A116、A117、A118、A119、A120、A121、A122、A123、A124、A125、A126、A127、A128、A129、A130、A131、A132、A133、A134、A135、A136、A137、A138、A139、A140、A141、A142、A143、A144、A145、A146、A147、A148、A149、A150、A151、A152、A153、A154、A155、A156、A157、A158、A159、A161、A162、A164、A166、A168、A169、A172、A173、A174、A178、A180、A181、A183、A184、A185、A186、A187、A188、A189、A192、A196、A197、A198、A200、A204、A205、A206、A207、A208、A209、A210、A211、A212、A213、A214、A215、A216、A217、A218、A219、A220、A223、A226、A228、A229、A230、A231、A232、A233。

[0785] 小菜蛾(Plutella xylostella)(小菜蛾(Diamond back moth))

[0786] 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。

[0787] 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:

[0788] A1、A2、A3、A4、A5、A6、A7、A8、A9、A10、A11、A12、A13、A14、A15、A16、A17、A18、A19、A20、A21、A22、A23、A24、A25、A27、A28、A29、A30、A31、A32、A33、A34、A35、A36、A37、A38、A39、A40、A41、A42、A43、A44、A45、A46、A48、A49、A50、A51、A52、A53、A54、A55、A56、A57、A58、A59、A60、A61、A62、A63、A64、A65、A66、A67、A68、A69、A70、A71、A72、A73、A74、A75、A76、A77、A78、A79、A80、A81、A82、A83、A84、A85、A86、A87、A88、A89、A90、A91、A92、A93、A94、A95、A96、A97、A98、A99、A100、A101、A102、A103、A104、A105、A106、A107、A108、A109、A110、A111、A112、A113、A114、A115、A116、A117、A118、A119、A120、A121、A122、A123、A124、A125、A126、A127、A128、A129、A130、A131、A132、A133、A134、A135、A136、A137、A138、A139、A140、A141、A142、A143、A144、A145、A146、A147、A148、A149、A150、A151、A152、A153、A154、A155、A156、A157、A158、A159、A160、A161、A162、A163、A164、A165、A166、A167、A168、A169、A170、A171、A172、

A173、A174、A176、A177、A178、A179、A180、A181、A182、A183、A184、A185、A186、A187、A188、A189、A190、A192、A193、A194、A195、A196、A197、A198、A199、A200、A201、A202、A203、A204、A205、A206、A207、A208、A209、A210、A211、A212、A213、A214、A215、A216、A217、A218、A219、A220、A221、A222、A223、A224、A225、A226、A227、A228、A229、A230、A231、A232、A233、A236、A237、A239。

[0789] 海灰翅夜蛾(埃及棉叶虫)

[0790] 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。

[0791] 以下化合物在200ppm施用率下得到至少80%的控制:

[0792] A1、A2、A3、A4、A5、A6、A7、A8、A9、A10、A11、A12、A13、A14、A15、A16、A17、A18、A19、A20、A21、A22、A23、A24、A25、A27、A28、A29、A30、A31、A32、A33、A34、A35、A36、A37、A38、A39、A40、A41、A42、A43、A44、A45、A46、A47、A48、A49、A50、A51、A52、A53、A54、A55、A56、A57、A58、A59、A60、A61、A62、A63、A64、A65、A66、A67、A68、A69、A70、A71、A72、A73、A74、A75、A76、A77、A78、A79、A80、A81、A82、A83、A84、A85、A86、A87、A88、A89、A90、A91、A92、A93、A94、A95、A96、A97、A98、A99、A100、A101、A102、A103、A104、A105、A106、A107、A108、A109、A110、A111、A112、A113、A114、A115、A116、A117、A118、A119、A120、A121、A122、A123、A124、A125、A126、A127、A128、A129、A130、A131、A132、A133、A134、A135、A136、A137、A138、A139、A140、A141、A142、A143、A144、A145、A146、A147、A148、A149、A150、A151、A152、A153、A154、A155、A156、A157、A158、A159、A160、A161、A162、A163、A164、A165、A166、A167、A168、A169、A170、A171、A172、A173、A174、A175、A176、A177、A178、A179、A180、A181、A182、A183、A184、A185、A186、A187、A188、A189、A190、A192、A193、A194、A195、A196、A197、A198、A199、A200、A201、A202、A203、A204、A205、A206、A207、A208、A209、A210、A211、A212、A213、A214、A215、A216、A217、A218、A219、A220、A221、A222、A223、A224、A225、A226、A227、A228、A229、A230、A231、A232、A233、A236、A237、A238、A239

[0793] 海灰翅夜蛾(埃及棉叶虫)

[0794] 将测试化合物用移液管从10'000ppm DMSO储备溶液施用到24孔板中并且与琼脂进行混合。将莴苣种子置于琼脂上并且用另一块也包含琼脂的平板封闭该多孔板。7天之后,根吸收了化合物并且莴苣生长进入了盖平板。然后,将这些莴苣叶切到盖平板中。将夜蛾属卵吸移穿过潮湿凝胶印记纸上的塑料模板及其所封闭的盖平板。侵染6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。

[0795] 以下化合物在12.5ppm测试比率下给出了三个类别(死亡率、拒食效果、或生长抑制)中至少一个的至少80%的效果:

[0796] A1、A5、A6、A8、A10、A11、A12、A13、A16、A19、A20、A21、A22、A23、A24、A25、A27、A28、A30、A31、A32、A33、A34、A35、A36、A37、A38、A39、A40、A41、A42、A44、A45、A48、A52、A57、A59、A61、A62、A63、A64、A65、A66、A67、A68、A69、A70、A72、A73、A75、A76、A78、A81、A82、A87、A90、A91、A95、A97、A98、A105、A107、A108、A109、A111、A112、A113、A114、A115、A116、A117、A118、

A119、A120、A121、A122、A123、A125、A126、A127、A128、A130、A131、A132、A133、A134、A135、A136、A137、A138、A139、A140、A141、A142、A143、A144、A145、A146、A147、A155、A158、A159、A160、A236。

[0797] 二点叶螨(二斑叶螨):摄食/接触活性

[0798] 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。

[0799] 以下化合物在200ppm施用率下得到至少80%的死亡率:

[0800] A1、A2、A3、A4、A5、A6、A7、A8、A9、A10、A11、A12、A13、A14、A15、A16、A17、A18、A19、A20、A21、A22、A23、A24、A25、A27、A28、A29、A30、A31、A32、A33、A34、A35、A36、A37、A38、A39、A40、A41、A42、A43、A44、A45、A46、A48、A49、A50、A51、A52、A53、A54、A55、A57、A58、A59、A60、A61、A62、A63、A64、A65、A66、A67、A68、A69、A70、A71、A72、A73、A74、A75、A76、A77、A78、A79、A80、A81、A82、A83、A84、A85、A86、A87、A88、A89、A90、A91、A92、A93、A94、A95、A96、A97、A98、A99、A100、A101、A102、A103、A104、A105、A106、A107、A108、A109、A110、A111、A112、A113、A114、A115、A116、A117、A118、A119、A120、A121、A122、A123、A124、A125、A126、A127、A128、A129、A130、A131、A132、A133、A134、A135、A136、A137、A138、A139、A140、A141、A142、A143、A144、A145、A146、A147、A148、A149、A150、A151、A152、A153、A154、A155、A156、A157、A158、A159、A160、A161、A162、A163、A164、A165、A166、A167、A168、A169、A170、A171、A172、A173、A174、A176、A178、A179、A180、A181、A182、A183、A184、A185、A186、A187、A188、A189、A190、A192、A193、A194、A195、A196、A197、A198、A199、A200、A201、A202、A203、A204、A205、A206、A207、A208、A209、A210、A211、A212、A213、A214、A215、A216、A217、A218、A219、A220、A221、A222、A223、A224、A225、A226、A227、A228、A229、A230、A231、A232、A233、A236。

[0801] 烟蓟马(葱蓟马)摄食/接触活性

[0802] 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。

[0803] 以下化合物在200ppm施用率下得到至少80%的死亡率:

[0804] A1、A2、A3、A4、A5、A6、A7、A8、A9、A10、A11、A12、A13、A14、A15、A16、A17、A18、A19、A20、A21、A22、A23、A24、A25、A27、A28、A29、A30、A31、A32、A33、A34、A35、A36、A37、A38、A39、A40、A41、A42、A43、A44、A45、A46、A48、A49、A50、A51、A52、A55、A57、A58、A59、A60、A61、A62、A63、A64、A65、A66、A67、A68、A69、A70、A71、A72、A73、A74、A75、A76、A77、A78、A79、A80、A81、A82、A83、A84、A85、A86、A87、A88、A89、A90、A91、A92、A93、A94、A95、A96、A97、A98、A99、A100、A101、A102、A103、A104、A105、A106、A107、A108、A109、A110、A111、A112、A113、A114、A115、A116、A117、A118、A119、A120、A121、A122、A123、A124、A125、A126、A127、A128、A129、A130、A131、A132、A133、A134、A135、A136、A137、A138、A139、A140、A141、A142、A143、A144、A145、A146、A147、A148、A149、A150、A151、A152、A153、A154、A155、A156、A157、A158、A159、A160、A161、A162、A163、A164、A165、A166、A167、A168、A169、A170、A171、A172、A173、A174、A176、A177、A178、A179、A180、A181、A182、A183、A184、A185、A186、A187、A188、A189、A190、A192、A193、A194、A195、A196、A197、A198、A199、A200、A202、A203、A204、A205、A206、A207、A208、

A209、A210、A211、A212、A213、A214、A215、A216、A217、A218、A219、A220、A221、A223、A224、A225、A226、A227、A228、A229、A230、A231、A232、A233、A236、A239。