(19)国家知识产权局

(12)发明专利申请

(10)申请公布号 CN 118556051 A
(43)申请公布日 2024.08.27

(21)申请号 202280071860.7
(22)申请日 2022.10.25
(30)优先权数据
202111048682 2021.10.25 IN
(85)PCT国际申请进入国家阶段日
2024.04.25
(86)PCT国际申请的申请数据
PCT/EP2022/079807 2022.10.25
(87)PCT国际申请的公布数据
WO2023/072945 EN 2023.05.04
(71)申请人 先正达农作物保护股份公司
地址 瑞士
(72)发明人 M·米尔巴赫 V·斯凯瓦
A·斯托勒 D·埃默里
O·F·许特 S·萨斯梅尔
(74)专利代理机构 中国贸促会专利商标事务所有限公司 11038
专利代理师 徐达
(51)Int.Cl.
C07D 405/04(2006.01)
C07D 491/04(2006.01)
A01N 43/40(2006.01)
A01N 43/16(2006.01)

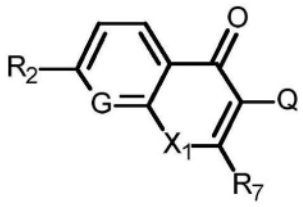
权利要求书6页 说明书111页

(54)发明名称

具有含硫取代基的杀有害生物活性的杂环衍生物

(57)摘要

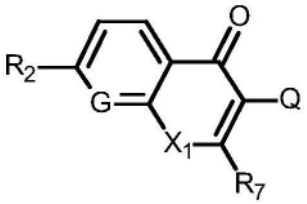
具有式(I)的化合物,其中取代基如权利要求1中所定义。此外,本发明涉及包含具有式(I)的化合物的农用化学组合物,涉及这些组合物的制备,并且涉及这些化合物或组合物在农业或园艺中用于对抗、预防或控制动物有害生物的用途,所述动物有害生物包括节肢动物且特别是昆虫、软体动物、线虫或蜱螨目的代表。



(I)

CN 118556051 A

1.一种具有式(I)的化合物



(I)

，

其中

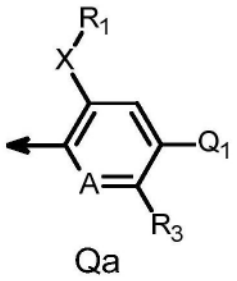
R_2是C_1-C_6卤代烷基、C_1-C_4卤代烷基硫烷基、C_1-C_4卤代烷基亚磺酰基、C_1-C_4卤代烷基磺酰基或C_1-C_6卤代烷氧基；

G是CH或N；

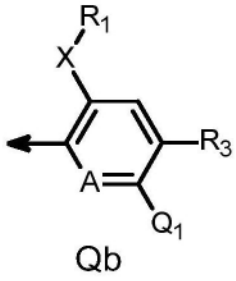
X_1是O、S或NR_6，其中R_6是C_1-C_4烷基；

R_7是氢、C_1-C_4烷基或卤素；

Q是选自由以下组成的组的基团：式Qa和Qb



Qa



Qb

，

其中箭头指示与双环的附接点；

并且其中A表示CH或N；

X是S、SO、SO_2；

R_1是C_1-C_4烷基或C_3-C_6环烷基-C_1-C_4烷基；

Q_1是氢、卤素、C_1-C_6卤代烷基、C_3-C_6环烷基、被氰基单取代的C_3-C_6环烷基、C_1-C_6氰基烷基、C_1-C_6氰基烷氧基、C_1-C_6卤代烷氧基、-$N(R_4)_2$、-$N(R_4)COR_5$或2-吡啶基氧基；或

Q_1是五至六元芳香族或杂芳香族环体系，经由环碳原子连接到含有取代基A的环，所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代或多取代：卤素、氰基、C_1-C_4烷基、C_1-C_4卤代烷基、C_1-C_4烷氧基、C_1-C_4卤代烷氧基、C_1-C_4烷基硫烷基、C_1-C_4烷基亚磺酰基和C_1-C_4烷基磺酰基；并且所述环体系可以包含1、2或3个选自由氮、氧和硫组成的组的环杂原子，其中所述环体系可以不包含多于一个环氧原子并且不包含多于一个环硫原子；或

Q_1是经由环氮原子连接到含有取代基A的环的五元杂芳香族环体系，所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代或多取代：卤素、氰基、C_1-C_4烷基、C_1-C_4卤代烷基、C_1-C_4烷氧基、C_1-C_4卤代烷氧基、C_1-C_4烷基硫烷基、C_1-C_4烷基亚磺酰基和C_1-C_4烷基磺酰基；并且所述环体系包含1、2或3个选自由氮、氧和硫组成的组的环杂原子，其中所述环体系包含至少一个环氮原子，并且可以不包含多于一个环氧原子并且不包含多于一个环硫原子；

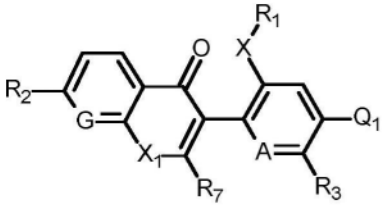
R_3是氢或C_1-C_4烷基；

每个R_4独立地是氢、C_1-C_4烷基或C_3-C_6环烷基；并且

R_5是C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤代烷基或C_3-C_6环烷基;

或具有式I的化合物的农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物。

2.根据权利要求1所述的具有式I的化合物,其由具有式I-1的化合物表示



(I-1),

其中R_2、G、X_1、R_6、R_7、A、X、R_1、Q_1、R_3、R_4和R_5如在权利要求1中的式I下所定义;或具有式I-1的化合物的农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物。

3.根据权利要求2所述的具有式I-1的化合物,其中

R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

G是CH或N;

X_1是O、S或NCH_3;

R_7是氢或甲基;

A是N或CH;

X是S或SO_2;

R_1是乙基或环丙基甲基;

Q_1是氢、三氟甲基、1,1-二氟乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、-N(CH_3)$COCH_3$、-N(CH_3)$COCH_2CH_3$、-N(CH_3)CO(环丙基)、或2-吡啶基氧基;并且

R_3是氢或甲基。

4.根据权利要求2所述的具有式I-1的化合物,其中

R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

G是CH;

X_1是O;

R_7是氢;

A是N;

X是SO_2;

R_1是乙基;

Q_1是氢、三氟甲基、1,1-二氟乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、-N(CH_3)$COCH_3$、-N(CH_3)$COCH_2CH_3$、-N(CH_3)CO(环丙基)、或2-吡啶基氧基;并且

R_3是氢。

5.根据权利要求2所述的具有式I-1的化合物,其中

R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

G是CH或N;

X_1是O、S或NCH_3;

R_7是氢或甲基;

A是N或CH;

X是S或SO_2;

R_1是乙基或环丙基甲基;

Q_1是可以被氯、氰基或三氟甲基单取代的N-连接的三唑基、C-连接的嘧啶基、或N-连接的吡唑基;并且

R_3是氢或甲基。

6.根据权利要求2所述的具有式I-1的化合物,其中

R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

G是CH;

X_1是O;

R_7是氢;

A是N;

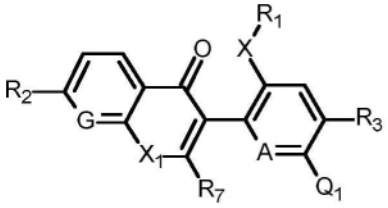
X是SO_2;

R_1是乙基;

Q_1是吡唑-1-基、3-氯-吡唑-1-基、3-氰基-吡唑-1-基、3-三氟甲基-吡唑-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基;并且

R_3是氢。

7.根据权利要求1所述的具有式I的化合物,其由具有式I-2的化合物表示



(I-2),

其中R_2、G、X_1、R_6、R_7、A、X、R_1、Q_1、R_3、R_4和R_5如在权利要求1中的式I下所定义;或具有式I-2的化合物的农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物。

8.根据权利要求7所述的具有式I-2的化合物,其中

R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

G是CH或N;

X_1是O、S或NCH_3;

R_7是氢或甲基;

A是N或CH;

X是S或SO_2;

R_1是乙基或环丙基甲基;

Q_1是氢、环丙基、-$NH(CH_3)$、-$N(CH_3)COCH_3$、-$N(CH_3)COCH_2CH_3$、或-$N(CH_3)CO$(环丙基);并且

R_3是氢或甲基。

9.根据权利要求7所述的具有式I-2的化合物,其中

R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

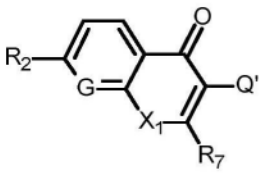
G是CH;

X_1是O;
R_7是氢;
A是N;
X是SO_2;
R_1是乙基;
Q_1是氢、环丙基、-NH(CH_3)、-N(CH_3)$COCH_3$、-N(CH_3)$COCH_2CH_3$、或-N(CH_3)CO(环丙基);并且
R_3是氢。

10.根据权利要求7所述的具有式I-2的化合物,其中
R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;
G是CH或N;
X_1是O、S或NCH_3;
R_7是氢或甲基;
A是N或CH;
X是S或SO_2;
R_1是乙基或环丙基甲基;
Q_1是N-连接的三唑基或C-连接的嘧啶基;并且
R_3是氢或甲基。

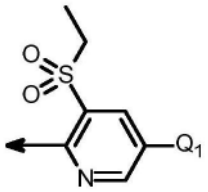
11.根据权利要求7所述的具有式I-2的化合物,其中
R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;
G是CH;
X_1是O;
R_7是氢;
A是N;
X是SO_2;
R_1是乙基;
Q_1是1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基;并且
R_3是氢。

12.根据权利要求1所述的具有式I的化合物,其由具有式I-3的化合物表示

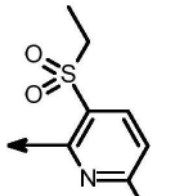


(I-3),

其中
R_2是C_1-C_2氟烷基或C_1-C_2氟烷氧基,优选地R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;
G是CH或N;
X_1是O、S或NCH_3;
R_7是氢或甲基;
Q'是选自由以下组成的组的基团:式Qa1和Qb1



Qa1



Qb1,

其中箭头指示与双环的附接点;

并且其中

Q_1是氢、三氟甲基、二氟乙基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、2-吡啶基氧基,可以被氯、氰基或三氟甲基单取代的N-连接的吡唑基;或Q_1是N-连接的三唑基、C-连接的嘧啶基或-N(R_4)COR_5,其中R_4是氢或甲基并且R_5是甲基、乙基或环丙基;或具有式I-3的化合物的农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物。

13.根据权利要求12所述的具有式I-3的化合物,其中Q_1是氢、三氟甲基、1,1-二氟乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、-N(CH_3)$COCH_3$、-N(CH_3)$COCH_2CH_3$、-N(CH_3)CO(环丙基)、2-吡啶基氧基、吡唑-1-基、3-氯-吡唑-1-基、3-氰基-吡唑-1-基、3-三氟甲基-吡唑-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

14.根据权利要求12所述的具有式I-3的化合物,其中Q_1是氢、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、N-连接的三唑基或C-连接的嘧啶基。

15.根据权利要求12所述的具有式I-3的化合物,其中Q_1是氢、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

16.根据权利要求12-15中任一项所述的具有式I-3的化合物,其中

G是CH;

X_1是O;并且

R_7是氢或甲基、优选地氢。

17.根据权利要求12-15中任一项所述的具有式I-3的化合物,其中

G是N;

X_1是O;并且

R_7是氢或甲基、优选地氢。

18.根据权利要求1所述的具有式I的化合物,其选自由以下组成的组:

3-(3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-7-(三氟甲基)色烯-4-酮(化合物P1);

3-(3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-7-(三氟甲基)色烯-4-酮(化合物P2);

1-[5-乙基硫烷基-6-[4-氧代-7-(三氟甲基)色烯-3-基]-3-吡啶基]环丙烷-甲腈(化合物P3);以及

1-[5-乙基磺酰基-6-[4-氧代-7-(三氟甲基)色烯-3-基]-3-吡啶基]环丙烷-甲腈(化合物P4)。

19.一种组合物,其包含杀昆虫、杀螨、杀线虫或杀软体动物有效量的如权利要求1-18中任一项所定义的具有式(I)的化合物、或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异

构体、互变异构体或N-氧化物,以及可选地,助剂或稀释剂。

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

21.一种用于保护植物繁殖材料免受昆虫、螨、线虫或软体动物攻击的方法,所述方法包括用根据权利要求19所述的组合物处理所述繁殖材料或种植所述繁殖材料的场所。

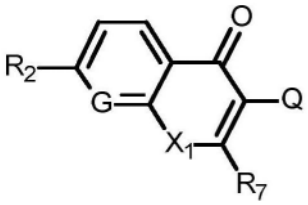
具有含硫取代基的杀有害生物活性的杂环衍生物

[0001] 本发明涉及含有硫取代基的杀有害生物活性(特别是杀昆虫活性)的杂环衍生物、其制备方法、包含那些化合物的组合物、以及它们用于控制动物有害生物(包括节肢动物并且特别是昆虫或蜱螨目的代表)的用途。

[0002] 含有硫取代基的杂环衍生物是已知的并且描述于例如WO 2019/131575、WO 2019/131587、WO 2020/158889、WO 2020/171077、WO 2020/203763、WO 2021/141106、WO 2020/178789和WO 2021/033141中。

[0003] 现在已经出人意料地发现,连接到(氮杂)色烯酮部分的某些新的含硫苯基和吡啶基衍生物作为杀有害生物剂具有有利的特性。

[0004] 因此,本发明提供了具有式I的化合物,

[0005] 

(I),

[0006] 其中

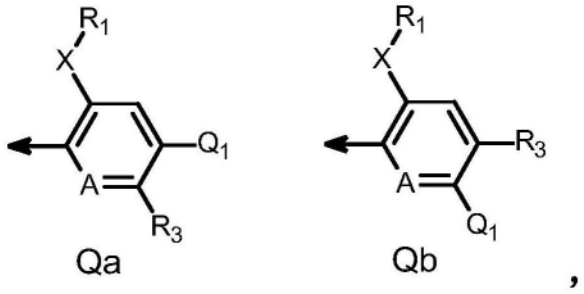
[0007] R_2是C_1-C_6卤代烷基、C_1-C_4卤代烷基硫烷基、C_1-C_4卤代烷基亚磺酰基、C_1-C_4卤代烷基磺酰基或C_1-C_6卤代烷氧基;

[0008] G是CH或N;

[0009] X_1是O、S或NR_6,其中R_6是C_1-C_4烷基;

[0010] R_7是氢、C_1-C_4烷基或卤素;

[0011] Q是选自由以下组成的组的基团:式Qa和Qb

[0012] 

,

[0013] 其中箭头指示与双环的附接点;

[0014] 并且其中A表示CH或N;

[0015] X是S、SO、SO_2;

[0016] R_1是C_1-C_4烷基或C_3-C_6环烷基-C_1-C_4烷基;

[0017] Q_1是氢、卤素、C_1-C_6卤代烷基、C_3-C_6环烷基、被氰基单取代的C_3-C_6环烷基、C_1-C_6氰基烷基、C_1-C_6氰基烷氧基、C_1-C_6卤代烷氧基、-$N(R_4)_2$、-$N(R_4)COR_5$或2-吡啶基氧基;或

[0018] Q_1是五至六元芳香族或杂芳香族环体系,经由环碳原子连接到含有取代基A的环,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代或多取代:卤素、氰基、C_1-C_4烷基、C_1-C_4卤代烷基、C_1-C_4烷氧基、C_1-C_4卤代烷氧基、C_1-C_4烷基硫烷基、C_1-C_4烷基亚磺

酰基和C_1-C_4烷基磺酰基;并且所述环体系可以包含1、2或3个选自由氮、氧和硫组成的组的环杂原子,其中所述环体系可以不包含多于一个环氧原子并且不包含多于一个环硫原子;或

[0019] Q_1是经由环氮原子连接到含有取代基A的环的五元杂芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代或多取代:卤素、氰基、C_1-C_4烷基、C_1-C_4卤代烷基、C_1-C_4烷氧基、C_1-C_4卤代烷氧基、C_1-C_4烷基硫烷基、C_1-C_4烷基亚磺酰基和C_1-C_4烷基磺酰基;并且所述环体系包含1、2或3个选自由氮、氧和硫组成的组的环杂原子,其中所述环体系包含至少一个环氮原子,并且可以不包含多于一个环氧原子并且不包含多于一个环硫原子;

[0020] R_3是氢或C_1-C_4烷基;

[0021] 每个R_4独立地是氢、C_1-C_4烷基或C_3-C_6环烷基;并且

[0022] R_5是C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤代烷基或C_3-C_6环烷基。

[0023] 本发明还提供了具有式I的化合物的农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体和N-氧化物。

[0024] 具有至少一个碱性中心的具有式I的化合物可以例如与以下项形成例如酸加成盐:强无机酸(如矿物酸,例如高氯酸、硫酸、硝酸、亚硝酸、磷酸或氢卤酸),强有机羧酸(如未取代的或例如被卤素取代的C_1-C_4烷羧酸,例如乙酸,如饱和或不饱和的二羧酸,例如草酸、丙二酸、琥珀酸、马来酸、富马酸或邻苯二甲酸,如羟基羧酸,例如抗坏血酸、乳酸、苹果酸、酒石酸或柠檬酸,或如苯甲酸),或有机磺酸(如未取代的或例如被卤素取代的C_1-C_4烷磺酸或芳基磺酸,例如甲烷磺酸或对甲苯磺酸)。具有至少一个酸性基团的具有式I的化合物可以例如与碱形成盐,例如矿物盐,如碱金属或碱土金属盐,例如钠盐、钾盐或镁盐;或与氨或有机胺(如吗啉,哌啶,吡咯烷,单、二或三低级烷基胺,例如乙胺、二乙胺、三乙胺或二甲基丙基胺,或单、二或三羟基低级烷基胺,例如单乙醇胺、二乙醇胺或三乙醇胺)形成盐。

[0025] 在每种情况下,根据本发明的具有式(I)的化合物是处于游离形式、处于氧化形式(如N-氧化物)或处于盐的形式(例如农艺学上可用的盐的形式)。

[0026] N-氧化物是叔胺的氧化形式或含氮杂芳香族化合物的氧化形式。例如,A.Albini和S.Pietra于1991年在博卡拉顿(Boca Raton)CRC出版社出版的名为“Heterocyclic N-oxides[杂环N-氧化物]”一书中描述了它们。

[0027] 根据本发明的具有式I的化合物还包括在盐形成期间可能形成的水合物。

[0028] 在取代基被指示为本身被进一步取代时,这意指它们带有一个或多个相同的或不同的取代基,例如一至四个取代基。通常地,同时存在不超过三个这样的任选的取代基。优选地,同时存在不多于两个这样的取代基(即,该基团被所指示取代基中的一个或两个取代)。在额外的取代基是较大的基团如环烷基或苯基时,最优选的是仅存在一个这样的任选的取代基。在基团被指示为被例如烷基取代时,这包括是其他基团的一部分的那些基团,例如烷硫基中的烷基。

[0029] 如本文所用,术语“C_1-C_n烷基”是指经由任一碳原子附接的具有1至n个碳原子的饱和直链或支链烃基,例如以下基团中的任一种:甲基、乙基、正丙基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、正己基、正戊基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基

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

[0030] 如本文所用,术语“C_1-C_n卤代烷基”是指经由任一碳原子附接的具有1至n个碳原子的直链或支链饱和烷基基团(如上所提及的),其中这些基团中的一些或全部氢原子可以被氟、氯、溴和/或碘替代,即,例如以下中的任一种:氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、2-氟乙基、2-氯乙基、2-溴乙基、2-碘乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基、2-氟丙基、3-氟丙基、2,2-二氟丙基、2,3-二氟丙基、2-氯丙基、3-氯丙基、2,3-二氯丙基、2-溴丙基、3-溴丙基、3,3,3-三氟丙基、3,3,3-三氯丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、七氟丙基、1-(氟甲基)-2-氟乙基、1-(氯甲基)-2-氯乙基、1-(溴甲基)-2-溴乙基、4-氟丁基、4-氯丁基、4-溴丁基或九氟丁基。因此,术语“C_1-C_2氟烷基”将是指带有1、2、3、4、或5个氟原子的C_1-C_2-烷基,例如以下中的任一种:二氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,1,2,2-四氟乙基或五氟乙基。

[0031] 如本文所用,术语“C_1-C_n烷氧基”是指经由氧原子附接的具有1至n个碳原子的直链或支链饱和烷基基团(如上所提及的),即,例如以下中的任一种:甲氧基、乙氧基、正丙氧基、1-甲基乙氧基、正丁氧基、1-甲基丙氧基、2-甲基丙氧基或1,1-二甲基乙氧基。

[0032] 如本文所用,术语“C_1-C_n卤代烷氧基”是指如上所提及的C_1-C_n烷氧基基团,其部分或全部被氟、氯、溴和/或碘取代,即,例如以下中的任一种:氯甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2-溴乙氧基、2-碘乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、五氟乙氧基、2-氟丙氧基、3-氟丙氧基、2,2-二氟丙氧基、2,3-二氟丙氧基、2-氯丙氧基、3-氯丙氧基、2,3-二氯丙氧基、2-溴丙氧基、3-溴丙氧基、3,3,3-三氟丙氧基、3,3,3-三氯丙氧基、2,2,3,3,3-五氟丙氧基、七氟丙氧基、1-(氟甲基)-2-氟乙氧基、1-(氯甲基)-2-氯乙氧基、1-(溴甲基)-2-溴乙氧基、4-氟丁氧基、4-氯丁氧基、或4-溴丁氧基。

[0033] 如本文所用,术语“C_1-C_n烷基硫烷基”是指经由硫原子附接的具有1至n个碳原子的直链或支链饱和烷基基团(如上所提及的),即,例如以下中的任一种:甲硫基、乙硫基、正丙硫基、1-甲基乙硫基、丁硫基、1-甲基丙硫基、2-甲基丙硫基或1,1-二甲基乙硫基。

[0034] 如本文所用,术语“C_1-C_n烷基亚磺酰基”是指经由亚磺酰基的硫原子附接的具有1至n个碳原子的直链或支链饱和烷基基团(如上所提及的),即,例如以下中的任一种:甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正丙基亚磺酰基、1-甲基乙基-亚磺酰基、正丁基亚磺酰基、1-甲基丙基亚磺酰基、2-甲基丙基亚磺酰基、1,1-二甲基-乙基亚磺酰基、正戊基亚磺酰基、1-甲基丁基亚磺酰基、2-甲基丁基亚磺酰基、3-甲基-丁基亚磺酰基、1,1-二甲基丙基亚磺酰基、1,2-二甲基丙基亚磺酰基、2,2-二甲基丙基亚磺酰基或1-乙基丙基亚磺酰基。

[0035] 如本文所用,术语“C_1-C_n烷基磺酰基”是指经由磺酰基的硫原子附接的具有1至n个碳原子的直链或支链饱和烷基基团(如上所提及的),即,例如以下中的任一种:甲基磺酰基、乙基磺酰基、正丙基磺酰基、异丙基磺酰基、正丁基磺酰基、1-甲基丙基磺酰基、2-甲基丙基磺酰基或叔丁基磺酰基。

[0036] 如本文所用,术语“C_1-C_n卤代烷基硫烷基”是指如上所提及的C1-C_n烷硫基,其部分或全部被氟、氯、溴和/或碘取代,即,例如以下中的任一种:氟甲硫基、二氟甲硫基、三氟甲硫基、氯二氟甲硫基、溴二氟甲硫基、2-氟乙硫基、2-氯乙硫基、2-溴乙硫基、2-碘乙硫基、2,2-二氟乙硫基、2,2,2-三氟乙硫基、2,2,2-三氯乙硫基、2-氯-2-氟乙硫基、2-氯-2,2-二氟乙硫基、2,2-二氯-2-氟乙硫基、五氟乙硫基、2-氟丙硫基、3-氟丙硫基、2-氯丙硫基、3-氯丙硫基、2-溴丙硫基、3-溴丙硫基、2,2-二氟丙硫基、2,3-二氟丙硫基、2,3-二氯丙硫基、3,3,3-三氟丙硫基、3,3,3-三氯丙硫基、2,2,3,3,3-五氟丙硫基、七氟丙硫基、1-(氟甲基)-2-氟乙硫基、1-(氯甲基)-2-氯乙硫基、1-(溴甲基)-2-溴乙硫基、4-氟丁硫基、4-氯丁硫基、或4-溴丁硫基。

[0037] 术语“C_1-C_n卤代烷基亚磺酰基”和“C_1-C_n卤代烷基磺酰基”是指以上基团,但是其中硫分别处于氧化态1或2。

[0038] 如本文所用,术语“C_1-C_n氰基烷基”是指被氰基取代的具有1至n个碳原子的直链或支链饱和烷基基团(如上所提及的),例如氰基亚甲基、氰基亚乙基、1,1-二甲基氰基甲基、氰基甲基、氰基乙基和1-二甲基氰基甲基。

[0039] 术语“C_1-C_n氰基烷氧基”是指经由氧原子附接的以上基团。

[0040] 如本文所用,在术语(如“C_3-C_n环烷基”)后的后缀“-C_1-C_n烷基”(其中n是1-6的整数)是指被C_3-C_n环烷基取代的直链或支链饱和烷基基团。C_3-C_n环烷基-C_1-C_n烷基的实例是例如,环丙基甲基。

[0041] 如本文所用,术语“C_3-C_6环烷基”是指3元-6元环烷基基团,如环丙烷、环丁烷、环丙烷、环戊烷和环己烷。

[0042] 本文所用的术语被氰基单取代的“C_3-C_n环烷基”是指被氰基取代的具有3至n个碳原子的饱和的或部分不饱和的单环、双环或三环烃(如上所提及)。

[0043] 卤素通常是氟、氯、溴或碘。这也相应地适用于与其他含义组合的卤素,如卤代烷基。

[0044] 在本发明的上下文中,Q_1取代基定义中的“单取代或多取代的”典型地是指,取决于取代基的化学结构,单取代的至五次取代的,更优选是单、二或三取代的。

[0045] 在本发明的上下文中,视情况而定,短语“Q_1是经由环碳原子连接的五元至六元芳香族或杂芳香族环体系…”以及短语“Q_1是经由环氮原子连接的五元杂芳香族环体系…”是指视情况而定,取代基Q_1的具体实施例与如由式Qa或式Qb表示的基团Q(其中Q也被X-R_1取代并且R_3如以上所描述)的附接方式,当A分别表示N或CH时,基团Q可以是吡啶基或苯基。

[0046] 在本发明的上下文中,“Q_1是经由环碳原子连接的五元至六元芳香族或杂芳香族环体系…;并且所述环体系可以包含1、2或3个杂原子…”的实例是但不限于苯基、吡唑基、三唑基、吡啶基和嘧啶基;优选苯基、2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、嘧啶-2-基、嘧啶-4-基、和嘧啶-5-基。

[0047] 在本发明的上下文中,“Q_1是经由环氮原子连接的五元杂芳香族环体系...;并且所述环体系包含1、2或3个杂原子…”的实例是但不限于吡唑基、吡咯基、咪唑基和三唑基;优选吡咯-1-基、吡唑-1-基、三唑-2-基、1,2,4-三唑-1-基、三唑-1-基、和咪唑-1-基。

[0048] 如下所列,提供了根据本发明的某些实施例。

[0049] 实施例1提供了如上定义的具有式I的化合物或其农用化学上可接受的盐、立体异

构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物。

[0050] 实施例2提供了根据实施例1所述的化合物或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中Q是Qa并且具有如以下所列的R_2、G、X_1、R_6、R_7、A、X、R_1、Q_1、R_3、R_4和R_5的优选值。

[0051] 实施例3提供了根据实施例1所述的化合物或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,其中Q是Qb并且具有如以下所列的R_2、G、X_1、R_6、R_7、A、X、R_1、Q_1、R_3、R_4和R_5的优选值。

[0052] 关于实施例1-3,R_2、G、X_1、R_6、R_7、A、X、R_1、Q_1、R_3、R_4和R_5的优选值在其任何组合中如以下所列:

[0053] 优选地,R_2是C_1-C_2氟烷基、三氟甲基硫烷基、三氟甲基亚磺酰基、三氟甲基磺酰基或C_1-C_2氟烷氧基。

[0054] 还优选的是当R_2是C_1-C_2氟烷基或C_1-C_2氟烷氧基时。

[0055] 更优选地,R_2是-CF_3、-CF_2CF_3、-CHF_2、-SCF_3、-SO_2CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$。

[0056] 甚至更优选地,R_2是-CF_3、-SO_2CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$。

[0057] 最优选地,R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$。

[0058] 优选地,G是CH或N。

[0059] 最优选地,G是CH。

[0060] 优选地,X_1是O、S或N(C_1-C_2烷基)。

[0061] 更优选地,X_1是O、S或NCH_3。

[0062] 最优选地,X_1是O。

[0063] 优选地,R_6是C_1-C_2烷基。

[0064] 更优选地,R_6是甲基或乙基。

[0065] 最优选地,R_6是甲基。

[0066] 优选地,R_7是氢、C_1-C_2烷基或氯。

[0067] 更优选地,R_7是氢或甲基。

[0068] 最优选地,R_7是氢。

[0069] 优选地,A是N或CH。

[0070] 最优选地,A是N。

[0071] 优选地,X是S或SO_2。

[0072] 最优选地,X是SO_2。

[0073] 优选地,R_1是C_1-C_4烷基或环丙基-C_1-C_4烷基。

[0074] 更优选地,R_1是乙基或环丙基甲基。

[0075] 最优选地,R_1是乙基。

[0076] 当Q是Qa时,优选地Q_1是氢、C_1-C_6卤代烷基、C_3-C_6环烷基、被氰基单取代的C_3-C_6环烷基、C_1-C_6氰基烷基、C_1-C_6氰基烷氧基、C_1-C_6卤代烷氧基、-N(R_4)COR_5或2-吡啶基氧基。

[0077] 还优选的是当Q_1是经由环碳原子连接至含有取代基A的环的五元至六元芳香族或杂芳香族环体系时,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和C_1-C_4卤代烷基;并且所述环体系可以含有1或2个环氮原子。

[0078] 还优选的是当Q_1是经由环氮原子连接至含有取代基A的环的五元杂芳香族环体系

时,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和C_1-C_4卤代烷基;并且所述环体系含有2或3个环氮原子。

[0079] 更优选地,Q_1是氢、三氟甲基、二氟乙基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、-N(R_4)COR_5,其中R_4是氢或甲基并且R_5是甲基、乙基或环丙基;或Q_1是可以被氯、氰基或三氟甲基单取代的2-吡啶基氧基、N-连接的吡唑基;或Q_1是N-连接的三唑基或C-连接的嘧啶基。

[0080] 最优选地,Q_1是氢、三氟甲基、1,1-二氟乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、-N(CH_3)$COCH_3$、-N(CH_3)$COCH_2CH_3$、-N(CH_3)CO(环丙基)、2-吡啶基氧基、吡唑-1-基、3-氯-吡唑-1-基、3-氰基-吡唑-1-基、3-三氟甲基-吡唑-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

[0081] 当Q是Qb时,优选地,Q_1是氢、C_3-C_6环烷基、-N(R_4)$_2$或-N(R_4)COR_5。

[0082] 还优选的是当Q_1是经由环碳原子连接至含有取代基A的环的五元至六元芳香族或杂芳香族环体系时,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和C_1-C_4卤代烷基;并且所述环体系可以含有1或2个环氮原子。

[0083] 还优选的是当Q_1是经由环氮原子连接至含有取代基A的环的五元杂芳香族环体系时,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和C_1-C_4卤代烷基;并且所述环体系含有2或3个环氮原子。

[0084] 更优选地,Q_1是氢、环丙基、-N(R_4)$_2$或-N(R_4)COR_5,在其中的每一个中,R_4独立地是氢或甲基并且R_5是甲基、乙基或环丙基;或Q_1是N-连接的三唑基或C-连接的嘧啶基。

[0085] 最优选地,Q_1是氢、环丙基、-NH(CH_3)、-N(CH_3)$COCH_3$、-N(CH_3)$COCH_2CH_3$、-N(CH_3)CO(环丙基)、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

[0086] 优选地,R_3是氢或C_1-C_4烷基。

[0087] 更优选地,R_3是氢或甲基。

[0088] 最优选地,R_3是氢。

[0089] 优选地,每个R_4独立地是氢或C_1-C_4烷基。

[0090] 最优选地,每个R_4独立地是氢或甲基。

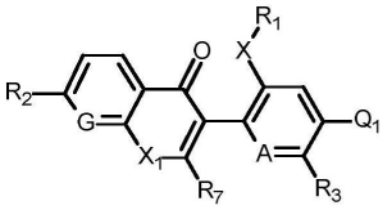
[0091] 优选地,R_5是C_1-C_6烷基或C_3-C_6环烷基。

[0092] 更优选地,R_5是甲基、乙基或环丙基。

[0093] 最优选地,R_5是甲基。

[0094] 如下所述,提供了根据本发明的另外的实施例。

[0095] 一组优选的具有式I的化合物由具有式I-1的化合物表示

[0096] 

(I-1),

[0097] 其中R_2、G、X_1、R_6、R_7、A、X、R_1、Q_1、R_3、R_4和R_5如以上在式I下所定义;或具有式I-1的化合物的农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物。

[0098] 在具有式I-1的化合物的一个优选的组中,

[0099] R_2是C_1-C_2氟烷基或C_1-C_2氟烷氧基;

[0100] G是CH或N;

[0101] X_1是O、S或NCH_3;

[0102] R_7是氢或甲基;

[0103] A是N或CH;

[0104] X是S或SO_2;

[0105] R_1是乙基或环丙基甲基;

[0106] Q_1是氢、C_1-C_6卤代烷基、C_3-C_6环烷基、被氰基单取代的C_3-C_6环烷基、C_1-C_6氰基烷基、C_1-C_6氰基烷氧基、C_1-C_6卤代烷氧基、2-吡啶基氧基、或-N(R_4)COR_5,其中R_4是氢或甲基并且R_5是甲基、乙基或环丙基;并且

[0107] R_3是氢或甲基。

[0108] 在具有式I-1的化合物的另一个优选的组中,

[0109] R_2是C_1-C_2氟烷基或C_1-C_2氟烷氧基;

[0110] G是CH或N;

[0111] X_1是O、S或NCH_3;

[0112] R_7是氢或甲基;

[0113] A是N或CH;

[0114] X是S或SO_2;

[0115] R_1是乙基或环丙基甲基;

[0116] Q_1是氢、三氟甲基、二氟乙基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、2-吡啶基氧基、或-N(R_4)COR_5,其中R_4是氢或甲基并且R_5是甲基、乙基或环丙基;并且

[0117] R_3是氢或甲基。

[0118] 在具有式I-1的化合物的另一个优选的组中,

[0119] R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

[0120] G是CH或N;

[0121] X_1是O、S或NCH_3;

[0122] R_7是氢或甲基;

[0123] A是N或CH;

[0124] X是S或SO_2;

[0125] R_1是乙基或环丙基甲基;

[0126] Q_1是氢、三氟甲基、1,1-二氟乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、-N(CH_3)$COCH_3$、-N(CH_3)$COCH_2CH_3$、-N(CH_3)CO(环丙基)、或2-吡啶基氧基;并且

[0127] R_3是氢或甲基。

[0128] 在具有式I-1的化合物的另一个优选的组中,

[0129] R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

[0130] G是CH;

[0131] X_1是O;

[0132] R_7是氢;

[0133] A是N;

[0134] X是SO_2;

[0135] R_1是乙基;

[0136] Q_1是氢、三氟甲基、1,1-二氟乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、-N(CH_3)$COCH_3$、-N(CH_3)$COCH_2CH_3$、-N(CH_3)CO(环丙基)、或2-吡啶基氧基;并且

[0137] R_3是氢。

[0138] 在具有式I-1的化合物的另一个进一步优选的组中,Q_1是经由环碳原子连接至含有取代基A的环的五元至六元芳香族或杂芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和C_1-C_4卤代烷基;并且所述环体系可以含有1或2个环氮原子。在此实施例中,更优选地,Q_1是C-连接的嘧啶基。

[0139] 还优选的具有式I-1的化合物是其中Q_1是经由环氮原子连接至含有取代基A的环的五元杂芳香族环体系的那些,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和C_1-C_4卤代烷基;并且所述环体系含有2或3个环氮原子。在此实施例中,更优选地,Q_1是可以被氯、氰基或三氟甲基单取代的N-连接的吡唑基;或Q_1是N-连接的三唑基。

[0140] 在具有式I-1的化合物的另一个优选的组中,

[0141] R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

[0142] G是CH或N;

[0143] X_1是O、S或NCH_3;

[0144] R_7是氢或甲基;

[0145] A是N或CH;

[0146] X是S或SO_2;

[0147] R_1是乙基或环丙基甲基;

[0148] Q_1是可以被氯、氰基或三氟甲基单取代的N-连接的三唑基、C-连接的嘧啶基、或N-连接的吡唑基;并且

[0149] R_3是氢或甲基。

[0150] 在具有式I-1的化合物的另一个优选的组中,

[0151] R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

[0152] G是CH;

[0153] X_1是O;

[0154] R_7是氢;

[0155] A是N;

[0156] X是SO_2;

[0157] R_1是乙基;

[0158] Q_1是吡唑-1-基、3-氯-吡唑-1-基、3-氰基-吡唑-1-基、3-三氟甲基-吡唑-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基;并且

[0159] R_3是氢。

[0160] 在以上提及的具有式I-1的化合物和具有式I-1的化合物的所有优选实施例中,除非另有说明,否则R_2、G、X_1、R_6、R_7、A、X、R_1、Q_1、R_3、R_4和R_5如以上在式I下所定义;

[0161] 优选地,R_2是C_1-C_2氟烷基或C_1-C_2氟烷氧基;最优选地,R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

[0162] 优选地,G是CH或N;最优选地,G是CH;

[0163] 优选地,X_1是O、S或NCH_3;最优选地,X_1是O;

[0164] 优选地,R_7是氢或甲基;最优选地,R_7是氢;

[0165] 优选地,A是N或CH;最优选地,A是N;

[0166] 优选地,X是S或SO_2;最优选地,X是SO_2;

[0167] 优选地,R_1是乙基或环丙基甲基;最优选地,R_1是乙基;

[0168] 优选地,Q_1是氢、三氟甲基、二氟乙基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、2-吡啶基氧基,可以被氯、氰基或三氟甲基单取代的N-连接的三唑基、C-连接的嘧啶基、N-连接的吡唑基;或Q_1是-$N(R_4)COR_5$,其中R_4是氢或甲基并且R_5是甲基、乙基或环丙基;最优选地,Q_1是氢、三氟甲基、1,1-二氟乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、-$N(CH_3)COCH_3$、-$N(CH_3)COCH_2CH_3$、-$N(CH_3)CO$(环丙基)、2-吡啶基氧基、吡唑-1-基、3-氯-吡唑-1-基、3-氰基-吡唑-1-基、3-三氟甲基-吡唑-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基;

[0169] 优选地,R_3是氢或甲基;最优选地,R_3是氢。

[0170] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-1-1)的化合物,其是具有式(I-1)的化合物,其中

[0171] R_2是C_1-C_2氟烷基或C_1-C_2氟烷氧基;

[0172] G是CH或N;

[0173] X_1是O、S或NCH_3;

[0174] R_7是氢或甲基;

[0175] A是N或CH;

[0176] X是S或SO_2;

[0177] R_1是乙基或环丙基甲基;

[0178] Q_1是氢、三氟甲基、二氟乙基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、2-吡啶基氧基,可以被氯、氰基或三氟甲基单取代的N-连接的吡唑基;或Q_1是N-连接的三唑基、C-连接的嘧啶基、或-$N(R_4)COR_5$,其中R_4是氢或甲基并且R_5是甲基、乙基或环丙基;并且

[0179] R_3是氢或甲基。

[0180] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-1-2)的化合物,其是具有式(I-1-1)的化合物,其中

[0181] Q_1是氢、三氟甲基、1,1-二氟乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、-$N(CH_3)COCH_3$、-$N(CH_3)COCH_2CH_3$、-$N(CH_3)CO$(环丙基)、2-吡啶基氧基、吡唑-1-基、3-氯-吡唑-1-基、3-氰基-吡唑-1-基、3-三氟甲基-吡唑-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

[0182] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-1-3)的化合物,其是具有式(I-1-1)的化合物,其中

[0183] Q_1是氢、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基或氰基异丙氧基。

[0184] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-1-4)的化合物,其是具有式(I-1-1)的化合物,其中

[0185] Q_1是氢、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基或1-氰基-1-甲基-乙氧基。

[0186] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-1-5)的化合物,其是具有式(I-1)的化合物,其中

[0187] R_2是C_1-C_2氟烷基或C_1-C_2氟烷氧基,优选地R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

[0188] G是CH或N;

[0189] X_1是O、S或NCH_3;

[0190] R_7是氢或甲基;

[0191] A是N;

[0192] X是SO_2;

[0193] R_1是乙基;

[0194] Q_1是氢、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基或1-氰基-1-甲基-乙氧基;并且

[0195] R_3是氢。

[0196] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-1-6)的化合物,其是具有式(I-1-5)的化合物,其中

[0197] G是CH;

[0198] X_1是O;并且

[0199] R_7是氢或甲基、优选地氢。

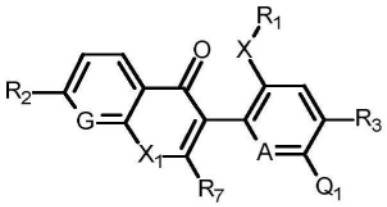
[0200] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-1-7)的化合物,其是具有式(I-1-5)的化合物,其中

[0201] G是N;

[0202] X_1是O;并且

[0203] R_7是氢或甲基、优选地氢。

[0204] 另一组优选的具有式I的化合物由具有式I-2的化合物表示

[0205]  **(I-2),**

[0206] 其中R_2、G、X_1、R_6、R_7、A、X、R_1、Q_1、R_3、R_4和R_5如以上在式I下所定义;或具有式I-2的化合物的农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物。

[0207] 在具有式I-2的化合物的一个优选的组中,

[0208] R_2是C_1-C_2氟烷基或C_1-C_2氟烷氧基;

[0209] G是CH或N;

[0210] X_1是O、S或NCH_3;

[0211] R_7是氢或甲基;

[0212] A是N或CH;

[0213] X是S或SO_2;

[0214] R_1是乙基或环丙基甲基;

[0215] Q_1是氢、C_3-C_6环烷基、-$N(R_4)_2$或-$N(R_4)COR_5$,在其中的每一个中,R_4独立地是氢或甲基并且R_5是甲基、乙基或环丙基;并且

[0216] R_3是氢或甲基。

[0217] 在具有式I-2的化合物的另一个优选的组中,

[0218] R_2是C_1-C_2氟烷基或C_1-C_2氟烷氧基;

[0219] G是CH或N;

[0220] X_1是O、S或NCH_3;

[0221] R_7是氢或甲基;

[0222] A是N或CH;

[0223] X是S或SO_2;

[0224] R_1是乙基或环丙基甲基;

[0225] Q_1是氢、环丙基、-$N(R_4)_2$或-$N(R_4)COR_5$,在其中的每一个中,R_4独立地是氢或甲基并且R_5是甲基、乙基或环丙基;并且

[0226] R_3是氢或甲基。

[0227] 在具有式I-2的化合物的另一个优选的组中,

[0228] R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

[0229] G是CH或N;

[0230] X_1是O、S或NCH_3;

[0231] R_7是氢或甲基;

[0232] A是N或CH;

[0233] X是S或SO_2;

[0234] R_1是乙基或环丙基甲基;

[0235] Q_1是氢、环丙基、-$NH(CH_3)$、-$N(CH_3)COCH_3$、-$N(CH_3)COCH_2CH_3$、或-$N(CH_3)CO$(环丙基);并且

[0236] R_3是氢或甲基。

[0237] 在具有式I-2的化合物的另一个优选的组中,

[0238] R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

[0239] G是CH;

[0240] X_1是O;

[0241] R_7是氢;

[0242] A是N;

[0243] X是SO_2;

[0244] R_1是乙基;

[0245] Q_1是氢、环丙基、-$NH(CH_3)$、-$N(CH_3)COCH_3$、-$N(CH_3)COCH_2CH_3$、或-$N(CH_3)CO$(环丙基);并且

[0246] R_3是氢。

[0247] 在具有式I-2的化合物的另一个进一步优选的组中,Q_1是经由环碳原子连接至含有取代基A的环的五元至六元芳香族或杂芳香族环体系,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和C_1-C_4卤代烷基;并且所述环体系可以含有1或2个环氮原子。在此实施例中,更优选地,Q_1是C-连接的嘧啶基。

[0248] 还优选的具有式I-2的化合物是其中Q_1是经由环氮原子连接至含有取代基A的环的五元杂芳香族环体系的那些,所述环体系是未取代的或被选自由以下组成的组的取代基单取代:卤素、氰基和C_1-C_4卤代烷基;并且所述环体系含有2或3个环氮原子。在此实施例中,更优选地,Q_1是N-连接的三唑基。

[0249] 在具有式I-2的化合物的另一个优选的组中,

[0250] R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

[0251] G是CH或N;

[0252] X_1是O、S或NCH_3;

[0253] R_7是氢或甲基;

[0254] A是N或CH;

[0255] X是S或SO_2;

[0256] R_1是乙基或环丙基甲基;

[0257] Q_1是N-连接的三唑基或C-连接的嘧啶基;并且

[0258] R_3是氢或甲基。

[0259] 在具有式I-2的化合物的另一个优选的组中,

[0260] R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

[0261] G是CH;

[0262] X_1是O;

[0263] R_7是氢;

[0264] A是N;

[0265] X是SO_2;

[0266] R_1是乙基;

[0267] Q_1是1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基;并且

[0268] R_3是氢。

[0269] 在以上提及的具有式I-2的化合物和具有式I-2的化合物的所有优选实施例中,除非另有说明,否则R_2、G、X_1、R_6、R_7、A、X、R_1、Q_1、R_3、R_4和R_5如以上在式I下所定义;

[0270] 优选地,R_2是C_1-C_2氟烷基或C_1-C_2氟烷氧基;最优选地,R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

[0271] 优选地,G是CH或N;最优选地,G是CH;

[0272] 优选地,X_1是O、S或NCH_3;最优选地,X_1是O;

[0273] 优选地,R_7是氢或甲基;最优选地,R_7是氢;

[0274] 优选地,A是N或CH;最优选地,A是N;

[0275] 优选地,X是S或SO_2;最优选地,X是SO_2;

[0276] 优选地,R_1是乙基或环丙基甲基;最优选地,R_1是乙基;

[0277] 优选地,Q_1是氢、环丙基、N-连接的三唑基、C-连接的嘧啶基、-$N(R_4)_2$或-$N(R_4)COR_5$,在其中的每一个中,R_4独立地是氢或甲基并且R_5是甲基、乙基或环丙基;最优选地,Q_1是氢、

环丙基、-NH(CH_3)、-N(CH_3)$COCH_3$、-N(CH_3)$COCH_2CH_3$、-N(CH_3)CO(环丙基)、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基;

[0278] 优选地,R_3是氢或甲基;最优选地,R_3是氢。

[0279] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-2-1)的化合物,其是具有式(I-2)的化合物,其中

[0280] R_2是C_1-C_2氟烷基或C_1-C_2氟烷氧基;

[0281] G是CH或N;

[0282] X_1是O、S或NCH_3;

[0283] R_7是氢或甲基;

[0284] A是N或CH;

[0285] X是S或SO_2;

[0286] R_1是乙基或环丙基甲基;

[0287] Q_1是氢、环丙基、N-连接的三唑基、C-连接的嘧啶基、-N(R_4)$_2$或-N(R_4)COR_5,在其中的每一个中,R_4独立地是氢或甲基并且R_5是甲基、乙基或环丙基;并且

[0288] R_3是氢或甲基。

[0289] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-2-2)的化合物,其是具有式(I-2-1)的化合物,其中

[0290] Q_1是氢、环丙基、-NH(CH_3)、-N(CH_3)$COCH_3$、-N(CH_3)$COCH_2CH_3$、-N(CH_3)CO(环丙基)、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

[0291] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-2-3)的化合物,其是具有式(I-2-1)的化合物,其中

[0292] Q_1是氢、环丙基、N-连接的三唑基或C-连接的嘧啶基。

[0293] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-2-4)的化合物,其是具有式(I-2-1)的化合物,其中

[0294] Q_1是氢、环丙基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

[0295] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-2-5)的化合物,其是具有式(I-2)的化合物,其中

[0296] R_2是C_1-C_2氟烷基或C_1-C_2氟烷氧基,优选地R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

[0297] G是CH或N;

[0298] X_1是O、S或NCH_3;

[0299] R_7是氢或甲基;

[0300] A是N;

[0301] X是SO_2;

[0302] R_1是乙基;

[0303] Q_1是氢、环丙基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基;并且

[0304] R_3是氢。

[0305] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-2-6)的化合物,其是具有式(I-2-5)的化合物,其中

[0306] G是CH;

[0307] X_1是O;并且

[0308] R_7是氢或甲基、优选地氢。

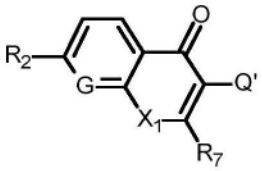
[0309] 根据此实施例的一组进一步优选的化合物是具有式(I-2-7)的化合物,其是具有式(I-2-5)的化合物,其中

[0310] G是N;

[0311] X_1是O;并且

[0312] R_7是氢或甲基、优选地氢。

[0313] 根据本发明的一组杰出的化合物是具有式I-3的那些

[0314]  **(I-3),**

[0315] 其中

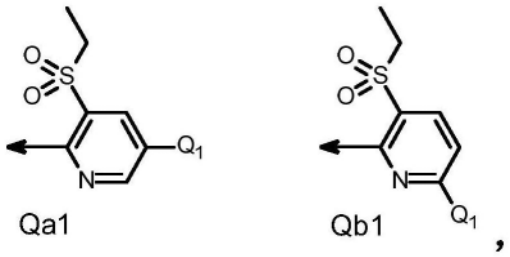
[0316] R_2是C_1-C_2氟烷基或C_1-C_2氟烷氧基,优选地R_2是-CF_3、-OCF_3或-$OCHF_2$;

[0317] G是CH或N;

[0318] X_1是O、S或NCH_3;

[0319] R_7是氢或甲基;

[0320] Q'是选自由以下组成的组的基团:式Qa1和Qb1

[0321] 
Qa1 Qb1 ,

[0322] 其中箭头指示与双环的附接点;

[0323] 并且其中

[0324] Q_1是氢、三氟甲基、二氟乙基、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、三氟乙氧基、二氟丙氧基、2-吡啶基氧基,可以被氯、氰基或三氟甲基单取代的N-连接的吡唑基;或Q_1是N-连接的三唑基、C-连接的嘧啶基或-N(R_4)COR_5,其中R_4是氢或甲基并且R_5是甲基、乙基或环丙基;或具有式I-3的化合物的农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物。

[0325] 根据此实施例的一组进一步杰出的化合物是具有式(I-3-1)的化合物,其是具有式(I-3)的化合物,其中

[0326] Q_1是氢、三氟甲基、1,1-二氟乙基、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氟丙氧基、-N(CH_3)$COCH_3$、-N(CH_3)$COCH_2CH_3$、-N(CH_3)CO(环丙基)、2-吡啶基氧基、吡唑-1-基、3-氯-吡唑-1-基、3-氰基-吡唑-1-基、3-三氟甲基-吡唑-1-基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

[0327] 根据此实施例的一组进一步杰出的化合物是具有式(I-3-2)的化合物,其是具有式(I-3)的化合物,其中

[0328] Q_1是氢、环丙基、氰基环丙基、氰基异丙基、氰基异丙氧基、N-连接的三唑基或C-连接的嘧啶基。

[0329] 根据此实施例的一组进一步杰出的化合物是具有式(I-3-3)的化合物,其是具有式(I-3)的化合物,其中

[0330] Q_1是氢、环丙基、1-氰基环丙基、1-氰基-1-甲基-乙基、1-氰基-1-甲基-乙氧基、1,2,4-三唑-1-基或嘧啶-2-基。

[0331] 根据此实施例的一组进一步杰出的化合物是具有式(I-3-4)的化合物,其是具有式(I-3-3)的化合物,其中

[0332] G是CH;

[0333] X_1是O;并且

[0334] R_7是氢或甲基、优选地氢。

[0335] 根据此实施例的一组进一步杰出的化合物是具有式(I-3-5)的化合物,其是具有式(I-3-3)的化合物,其中

[0336] G是N;

[0337] X_1是O;并且

[0338] R_7是氢或甲基、优选地氢。

[0339] 根据本发明的化合物可以具有任何数量的益处,尤其包括对于保护植物抵抗昆虫的有利水平的生物活性或对于用作农用化学品活性成分的优越特性(例如,更高的生物活性、有利的活性谱、增加的安全特征曲线、改善的物理-化学特性、或增加的生物可降解性或环境特征曲线)。特别地,已经出人意料地发现某些具有式(I)的化合物相对于非目标节肢动物,特别是传粉者(如蜜蜂、独居蜂、和熊蜂),可以显示出有利的安全特征曲线。最特别地,相对于意大利蜂(Apis mellifera)。

[0340] 在另一方面,本发明提供了一种组合物,其包含杀昆虫、杀螨、杀线虫或杀软体动物有效量的如在具有式(I-1)、(I-2)和(I-3)的化合物下的实施例(上文)中任一个所定义的具有式(I)的化合物、或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,以及任选地,助剂或稀释剂。

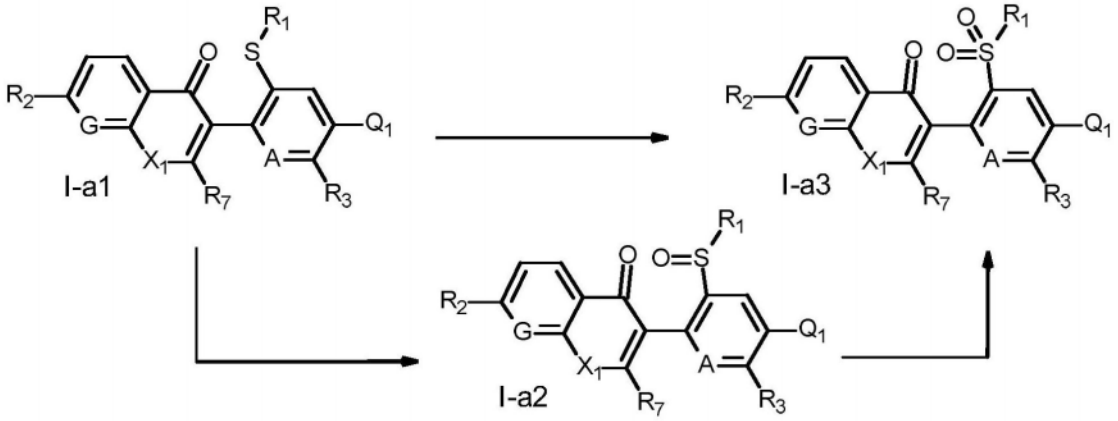
[0341] 在另一方面,本发明提供了一种对抗和控制昆虫、螨、线虫或软体动物的方法,该方法包括向有害生物、有害生物的场所、或易受有害生物攻击的植物施用杀昆虫、杀螨、杀线虫或杀软体动物有效量的如在具有式(I-1)、(I-2)和(I-3)的化合物下的实施例(上文)中任一个所定义的具有式(I)的化合物、或其农用化学上可接受的盐、立体异构体、对映异构体、互变异构体或N-氧化物,或如上定义的组合物。

[0342] 在又另一方面,本发明提供了一种用于保护植物繁殖材料免受昆虫、螨、线虫或软体动物攻击的方法,该方法包括用如上定义的组合物处理该繁殖材料或该繁殖材料所种植的场地。

[0343] 根据本发明的用于制备具有式I的化合物的方法原则上通过本领域的技术人员已知的方法进行。更特别地,并且如方案1和方案2中所述,具有式I的化合物的亚组(其中X是SO(亚砜)和/或SO_2(砜))可以借助对应的具有式I的硫化物(其中X是S)的氧化反应来获得,该氧化反应涉及试剂例如像间氯过氧苯甲酸(mCPBA)、过氧化氢、在过硫酸氢钾制剂(oxone)、高碘酸钠、次氯酸钠或次氯酸叔丁酯以及其他氧化剂。该氧化反应通常是在溶剂

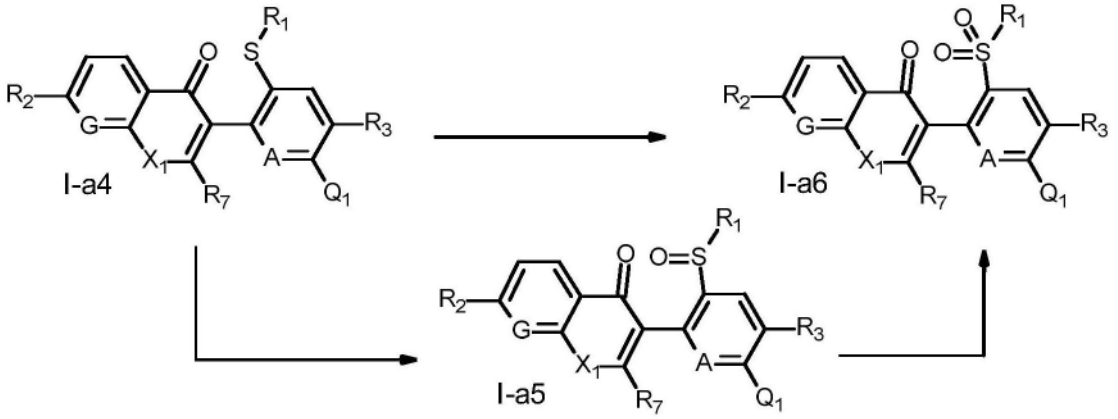
的存在下进行的。用于该反应的溶剂的实例包括脂肪族卤代烃,如二氯甲烷和氯仿;酯,如乙酸乙酯;醇,如甲醇和乙醇;乙酸;水;及其混合物。用于该反应的氧化剂的量相对于1摩尔的生成亚砜化合物I的硫化物化合物I通常是1摩尔至3摩尔,优选1摩尔至1.2摩尔,并且相对于1摩尔的生成砜化合物I的硫化物化合物I优选是2摩尔至2.2摩尔的氧化剂。此类氧化反应例如披露于WO 2013/018928中。

[0344] 方案1(所有取代基如式I中所定义)

[0345] 

[0346] 以上在方案1中所述的由具有式I-a1的化合物得到具有式I-a2和式I-a3的化合物的化学过程可以类似地应用于(方案2)由具有式I-a4的化合物制备具有式I-a5和式I-a6的化合物,其中先前提到的所有取代基定义仍然有效。

[0347] 方案2

[0348] 

[0349] 具有式I的化合物(其中R_2、G、X_1和R_7如在式I中所定义并且其中Q被定义为Qa,其中Q_1、R_3、X、A和R_1如在式I中所定义)的亚组可以被定义为具有式I-Qa的化合物。

[0350] 方案3

[0351] 

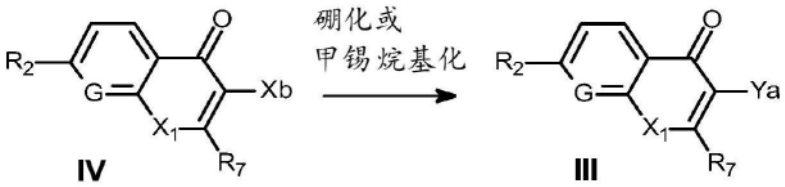
[0352] 具有式I-Qa的此类化合物可以通过铃木(Suzuki)交叉偶联反应来制备(方案3),该反应涉及例如使具有式II-Qa的化合物(其中Q_1、R_3、X、A和R_1如式I中所定义,并且其中Xa是离去基团,像例如氯、溴或碘,或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯,如三氟甲磺酸酯)与具有式

III的化合物(其中R_2、G、X_1和R_7如式I中所定义,并且其中Ya是硼衍生的官能团,例如像B(OH)$_2$或B(OR$_{b1}$)$_2$,其中R_{b1}可以是C_1-C_4烷基或这两个基团OR$_{b1}$可以与硼原子一起形成五元环,像例如频哪醇硼酸酯)反应。反应可以通过钯基催化剂例如四(三苯基-膦)钯或(1,1'双(二苯基膦基)二茂铁)二氯化钯-二氯甲烷(1:1络合物),在碱如碳酸钠、碳酸钾或氟化铯的存在下,在溶剂或溶剂混合物像例如1,2-二甲氧基乙烷和水的混合物或二噁烷和水的混合物或乙腈和水的混合物中,优选地在惰性气氛下来催化。反应温度的范围可以优先地是从环境温度到反应混合物的沸点。此类铃木反应是本领域技术人员熟知的,并且已经综述于例如J.Orgmet.Chem.[有机金属化学杂志]576,1999,147-168中。

[0353] 可替代地,具有式I-Qa的化合物可以通过具有式III的化合物(其中Ya是三烷基锡衍生物、优选地三正丁基锡)与具有式II-Qa的化合物(其中Xa是离去基团,像例如氯、溴或碘,或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯,如三氟甲磺酸酯)的施蒂勒交叉偶联反应制备。此类施蒂勒反应通常在钯催化剂(例如四(三苯基膦)-钯(0)、或(1,1'双(二苯基膦基)-二茂铁)二氯钯-二氯甲烷(1:1络合物))存在下、在惰性溶剂(如DMF、乙腈、或二噁烷)中、可选地在添加剂(如氟化铯或氯化锂)存在下、并且可选地在另外的催化剂例如碘化铜(I)存在下进行。此类施蒂勒偶联也是本领域技术人员熟知的并且已经描述于例如J.Org.Chem.[有机化学杂志],2005,70,8601-8604、J.Org.Chem.[有机化学杂志],2009,74,5599-5602和Angew.Chem.Int.Ed.[应用化学国际版],2004,43,1132-1136中。

[0354] 具有式III的化合物(其中R_2、G、X_1和R_7如式I中所定义,并且其中Ya是硼衍生的官能团,例如像B(OH)$_2$或B(OR$_{b1}$)$_2$,其中R_{b1}可以是C_1-C_4烷基或这两个基团OR$_{b1}$可以与硼原子一起形成五元环,像例如频哪醇硼酸酯),

[0355] 方案4

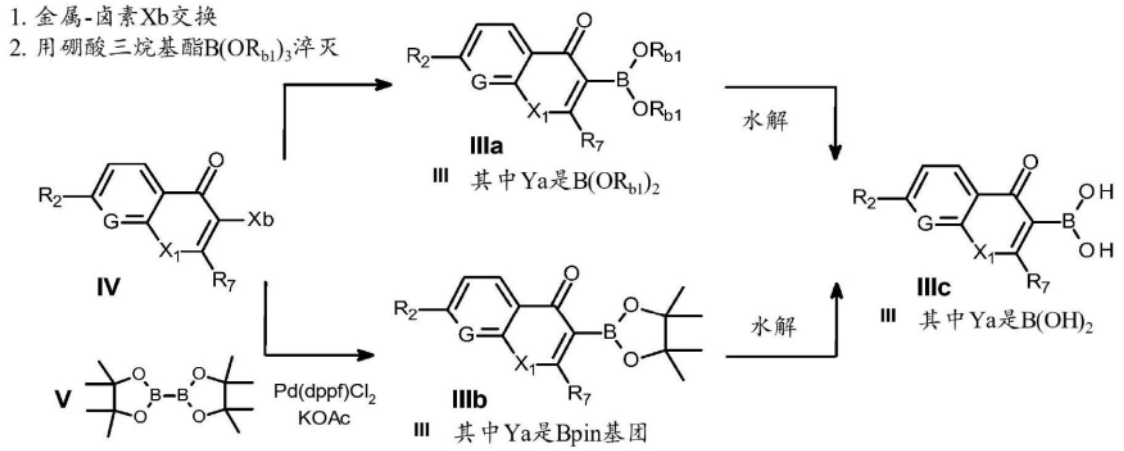
[0356] 

[0357] 可以通过使具有式IV的化合物(其中R_2、G、X_1和R_7如式I中所定义,并且其中Xb是离去基团,例如像氯、溴或碘)在方案5中详述的硼化条件下反应(方案4)来制备。

[0358] 可替代地,具有式III的化合物(其中R_2、G、X_1和R_7如式I中所定义,并且其中Ya是三烷基锡衍生物、优选地三正丁基锡)可以经由甲锡烷基化步骤来制备,该步骤涉及例如使具有式IV的化合物与有机金属物质像例如有机镁化合物(例如异丙基氯化镁)反应,以经由金属-卤素交换产生中间体物质,该金属-卤素交换优选地在无水非质子溶剂如四氢呋喃中在低温下、优选地在-78℃与0℃之间进行,并且用具有式(烷基)$_3$SnCl的锡试剂例如三正丁基氯化锡(正丁基)$_3$SnCl淬灭所述中间体物质。

[0359] 类似地,具有式IIIa的化合物(具有式III的化合物的亚组)(其中R_2、G、X_1和R_7如式I中所定义,并且其中Ya是B(OR$_{b1}$)$_2$,其中R_{b1}是C_1-C_4烷基),

[0360] 方案5

[0361] 

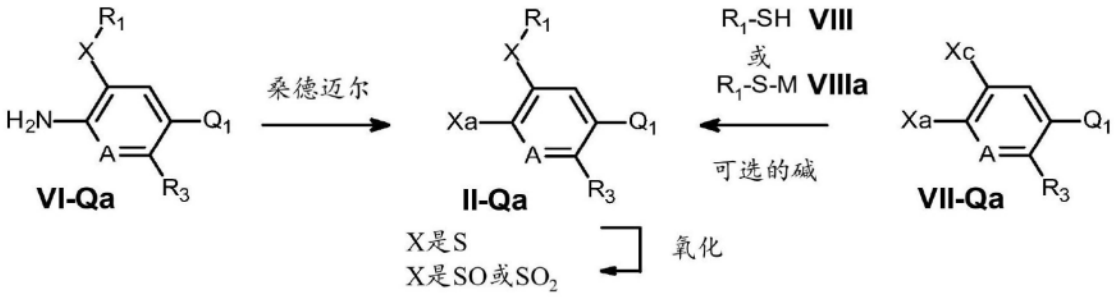
[0362] 可以通过使具有式IV的化合物(其中R_2、G、X_1和R_7如式I中所定义,并且其中Xb是离去基团,例如像氯、溴或碘)与有机金属物质像例如有机镁化合物(例如异丙基氯化镁或异丙基氯化镁氯化锂络合物)反应,以经由金属-卤素交换产生中间体物质,该金属-卤素交换优选地在无水非质子溶剂如四氢呋喃中在低温下、优选地在-78℃与0℃之间进行,并且使所述中间体物质与具有式$B(OR_{b1})_3$(其中R_{b1}是C_1-C_4烷基)的三烷基硼酸酯试剂反应来制备(方案5)。取决于三烷基硼酸酯的性质、反应处理条件和后处理条件,可以形成和分离二烷基硼酸酯IIIa,或可以直接获得具有式IIIc(具有式III的化合物的另一个亚组)(其中R_2、G、X_1和R_7如式I中所定义)的硼酸化合物。此类条件已经描述于文献,例如WO 2017/122722中。

[0363] 具有式IIIb的化合物(具有式III的化合物的又另一个亚组)(其中R_2、G、X_1和R_7如式I中所定义,并且其中Ya是频哪醇硼酸酯(也称为Bpin基团,其中这两个基团OR_{b1}与硼原子一起形成五元环的情况))可以通过使具有式IV的化合物(其中R_2、G、X_1和R_7如式I中所定义,并且其中Xb是离去基团,例如像氯、溴或碘)与具有式V的双(频哪醇合)二硼烷在钯催化的反应条件下反应来制备。典型地,此类条件涉及1,1'双(二苯基膦基)二茂铁)二氯化钯(II)(可选地作为二氯甲烷加合物),在碱如乙酸钾或碳酸钾的存在下,在惰性溶剂如二噁烷、N,N-二甲基甲酰胺或乙腈中,优选地在惰性气氛下,在范围从环境温度至反应混合物的沸点的温度下。此类条件已经描述于文献,例如Bioorg.Med.Chem.[生物有机与药物化学]15,7138-7143(2007)中。取决于反应处理条件和后处理条件,将原位形成频哪醇硼酸酯IIIb,并且可以直接获得具有式IIIc的硼酸化合物。此类条件已经描述于文献,例如Chem.Pharm.Bull.[化学与药学通报]68(8):797-801(2020)中。

[0364] 将具有式IIIa或IIIb的化合物水解为具有式IIIc的化合物(如以上所定义的所有取代基)可以通过本领域技术人员已知的方法,例如用水,可选地在共溶剂如戊烷、四氢呋喃或甲醇的存在下,可选地在酸(如盐酸)水溶液或碱(如氢氧化锂、氢氧化钠或氢氧化钾)水溶液的存在下,优选地在0℃与40℃之间、甚至更优选地在约10℃至30℃的温度下进行。

[0365] 具有式II-Qa的化合物(其中Q_1、R_3、X、A和R_1如式I中所定义,并且其中Xa是离去基团,像例如氯、溴或碘),

[0366] 方案6

[0367] 

[0368] 可以通过使具有式VI-Qa的化合物(其中Q_1、R_3、X、A和R_1如式I中所定义)与亚硝酸酯(如亚硝酸叔丁酯t-BuONO或亚硝酸异戊酯(非水性条件的实例))或亚硝酸钠在水中氢卤酸HXa(水性条件)和铜盐Cu(I)Xa(其中Xa是离去基团,像例如氯、溴或碘)的存在下在桑德迈尔型反应条件下反应来制备(方案6)。此转化优选地在惰性溶剂(如乙腈或卤化溶剂像1,2-二氯乙烷或1,2-二溴乙烷(非水性条件)、或水)中,在0℃-150℃之间的温度下,优选地在范围从室温至反应混合物的沸点的温度下进行。

[0369] 可替代地,具有式II-Qa的化合物(其中X是S,并且其中Q_1、R_3、A和R_1如式I中所定义,并且其中Xa是离去基团,像例如氯、溴或碘,或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯,如三氟甲磺酸酯)可以通过使具有式VII-Qa的化合物(其中Q_1、R_3和A如式I中所定义,并且其中Xa是离去基团,像例如氯、溴或碘,或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯,如三氟甲磺酸酯,并且其中Xc是离去基团,例如像氟或硝基)与具有式VIII的试剂

[0370] R_1-SH(VIII),

[0371] 或其盐(其中R_1如式I中所定义),可选地在合适的碱(如碱金属碳酸盐,例如碳酸钠和碳酸钾,或碱金属氢化物如氢化钠,或碱金属氢氧化物如氢氧化钠和氢氧化钾,或叔丁醇钠或叔丁醇钾)的存在下,在惰性溶剂中,在优选地在25℃-120℃之间的温度下反应来制备。待使用的溶剂的实例包括醚,如四氢呋喃THF、乙二醇二甲醚、叔丁基甲基醚和1,4-二噁烷;芳香族烃,如甲苯和二甲苯;腈,如乙腈;或极性非质子溶剂,如N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基-2-吡咯烷酮NMP或二甲基亚砜。具有式VIII的化合物的盐的实例包括具有式VIIIa的化合物

[0372] R_1-S-M(VIIIa),

[0373] 其中R_1是如上所定义的并且其中M例如是钠或钾。制备具有式VIII的化合物的此种方法可以例如在WO 16/091731中找到。

[0374] 可替代地,形成II-Qa的此反应可以在钯催化剂(如三(二亚苄基丙酮)二钯(0))的存在下在膦配体(如xanthphos)的存在下,在惰性溶剂(例如,二甲苯)中,在100℃-160℃之间的温度(优选140℃)下进行,如在Tetrahedron[四面体]2005,61,5253-5259中描述的。

[0375] 将具有式II-Qa的化合物(其中X是S,并且其中Q_1、R_3、A和R_1如式I中所定义,并且其中Xa是离去基团,像例如氯、溴或碘,或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯如三氟甲磺酸酯)用合适的氧化剂氧化成具有式II-Qa的化合物(其中X是SO或SO_2)可以在以上已经描述的条件下实现。

[0376] 具有式II-Qa的某些化合物(其中Q_1、R_3、X、A和R_1如式I中所定义,并且其中Xa是离去基团,例如像氯)是已知的并且描述于WO 2019/131587中。具有式II-Qa的其他化合物可以类似于所述文献中发现的制备描述来制备。

[0377] 具有式VI-Qa的某些化合物(其中Q_1、R_3、X、A和R_1如式I中所定义)是已知的并且描述于WO 2020/174094中。具有式VI-Qa的其他化合物可以类似于所述文献中发现的制备描述来制备,或可以通过本领域技术人员已知的方法制备。

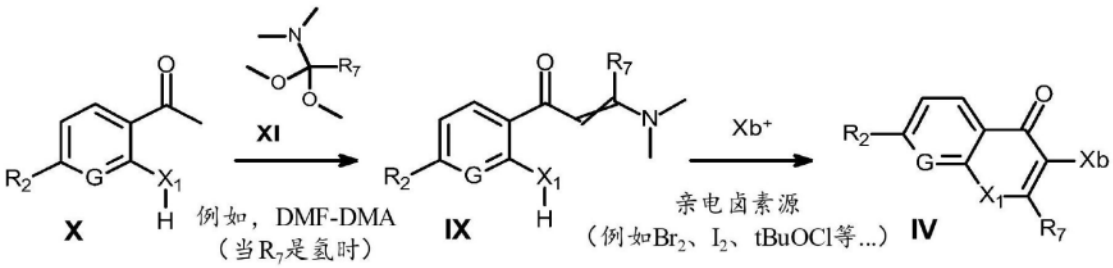
[0378] 具有式VII-Qa的化合物(其中Q_1、R_3和A如式I中所定义,并且其中Xa是离去基团,像例如氯、溴或碘,或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯如三氟甲磺酸酯,并且其中Xc是离去基团,例如像氟或硝基);以及

[0379] 具有式VIII和VIIIa的试剂、或其盐(其中R_1如式I中所定义);

[0380] 是已知的、可商购的或可以通过本领域技术人员已知的方法来制备。

[0381] 具有式IV的化合物(其中R_2、G和X_1如式I中所定义,并且R_7是氢或C_1-C_4烷基,并且其中Xb是离去基团,例如像氯、溴或碘),

[0382] 方案7

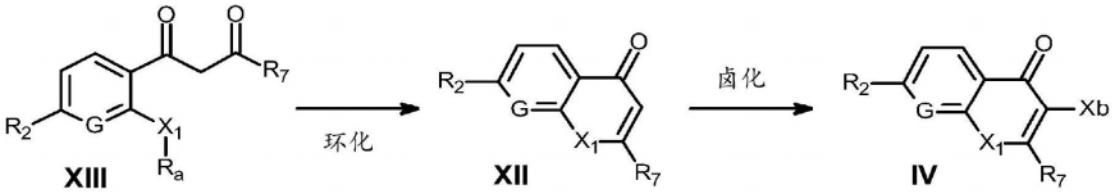
[0383] 

[0384] 可以通过使具有式IX的化合物(其中R_2、G和X_1如式I中所定义,并且R_7是氢或C_1-C_4烷基)与亲电卤素源Xb^+试剂(如溴Br_2、N-溴代琥珀酰亚胺NBS、碘I_2或次氯酸叔丁酯tBuOCl等)(其中Xb是氯、溴或碘)在惰性溶剂(如二氯甲烷、氯仿、乙腈、二甲基乙酰胺、甲醇、乙醇或吡啶)中在0℃与50℃之间的温度下反应来制备(方案7)。

[0385] 具有式IX的化合物(其中R_2、G和X_1如式I中所定义并且R_7是氢或C_1-C_4烷基)可以通过使具有式X的化合物(其中R_2、G和X_1如式I中所定义)与具有式XI的试剂(其中R_7是氢或C_1-C_4烷基)在加热条件下,可选地在稀释剂(如N,N-二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺、甲苯或二甲苯)的存在下,在50℃与180℃之间的温度下、优选地在范围从80℃至反应混合物的沸点的温度下反应来制备。典型地,具有式XI的试剂是例如N,N-二甲基-甲酰胺二甲基乙缩醛DMF-DMA(R_7是H)或1,1-二甲氧基-N,N-二甲基-乙胺(R_7是甲基),它们是商业的或可以根据已知程序制备。此类条件(对于方案7中的两个步骤)已经描述于文献,例如Synthesis[合成]901-903(1979),Bioorg.Med.Chem.Lett.[生物有机与药物化学快报]25,2510-2513(2015)或Eur.J.Org.Chem.[欧洲有机化学杂志]6440-6446(2020)中。

[0386] 可替代地,具有式IV的化合物(其中R_2、G、X_1和R_7如式I中所定义,并且其中Xb是离去基团,例如像氯、溴或碘),

[0387] 方案8

[0388] 

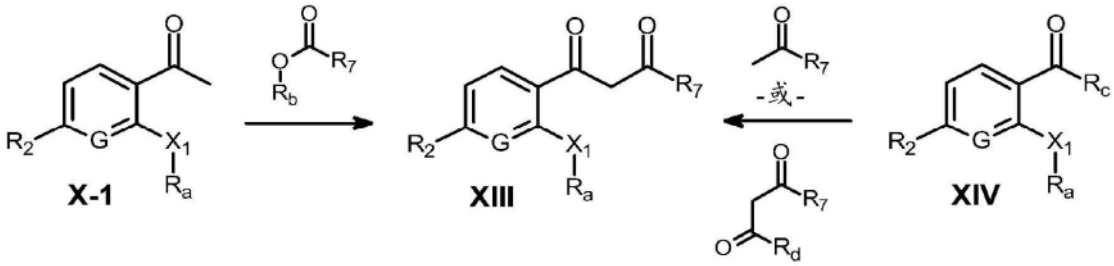
[0389] 可以通过对具有式XII的化合物(其中R_2、G、X_1和R_7如式I中所定义)进行卤化反应来制备(方案8)。合适的条件,优选地当R_7是氢或C_1-C_4烷基时,可以涉及使具有式XII的化合

物与吡咯烷或哌啶在醇(如甲醇或乙醇)中在30℃与100℃之间的温度下、优选地在范围从60℃至反应混合物的沸点的温度下反应,以形成烯氨基酮中间体。随后用具有式$(Xb)_2$的卤化试剂(其中Xb是氯、溴或碘)在惰性溶剂(例如像氯仿)中,在0℃与40℃之间的温度下处理所述烯氨基酮中间体,可以提供具有式IV的化合物,如Synthesis[合成]719-7821(1981)或Synthesis[合成]901-903(1979)中所描述的。可替代地,氧化卤化条件也可以适用于形成具有式IV的化合物,例如通过使具有式XII的化合物与氢卤酸HXb(其中Xb是氯、溴或碘)在过硫酸氢钾制剂(Synthesis[合成](2004),2641-2644;优选地Xb是氯或溴)或间氯过氧苯甲酸(Synthesis[合成](1993),283-4;优选地Xb是氯)作为氧化剂的存在下,在惰性溶剂(例如像二氯甲烷或N,N-二甲基甲酰胺)中,在0℃与40℃之间的温度下反应。其他氧化卤化条件可以涉及硝酸铈铵(CAN)和碘(Xb是碘),在惰性溶剂(例如像乙腈)中,在50℃与90℃之间的温度下,如Tetrahedron Letters[四面体快报]72(2021)文章153070(https://doi.org/10.1016/j.tetlet.2021.153070)中所描述的。

[0390] 具有式XII的化合物(其中R_2、G和X_1如式I中所定义并且R_7是氢或C_1-C_4烷基)可以通过使具有式XIII的化合物(其中R_2、G和X_1如式I中所定义并且R_7是氢或C_1-C_4烷基,并且其中Ra是氢或C_1-C_4烷基),在酸(如盐酸、氢溴酸、硫酸、对甲苯磺酸或多聚磷酸)的存在下,在惰性溶剂(如乙酸、甲醇、乙醇、二甲基亚砜或水(或其混合物))中,在0℃与100℃之间、优选地在室温与80℃之间的温度下环化来制备。此类条件已经描述于文献,例如J.Med.Chem.[药物化学杂志]33,1859-1865(1990)中。在其中Ra是C_1-C_4烷基的特定情况下,环化可以通过使用碳酸钾(可选地以催化剂量)在惰性溶剂(如N,N-二甲基甲酰胺或二甲基乙酰胺)中在80℃与180℃之间的温度下实现,如Organic Letters[有机快报]14,2710-2713(2012)中所描述的。

[0391] 具有式XIII的化合物(其中R_2、G和X_1如式I中所定义,并且R_7是氢或C_1-C_4烷基,并且其中Ra是氢或C_1-C_4烷基),

[0392] 方案9

[0393] 

[0394] 可以典型地通过克莱森缩合型化学反应在本领域技术人员已知的条件下由具有式X-1或XIV的起始材料制备(方案9)。例如,具有式XIII的化合物可以通过具有式X-1的化合物(其中R_2、G和X_1如式I中所定义,并且其中Ra是氢或C_1-C_4烷基)与具有式$R_7C(O)OR_b$的试剂(其中R_7是氢或C_1-C_4烷基并且R_b是C_1-C_4烷基(优选地甲基或乙基))在碱(如氢化钠、甲醇钠、乙醇钠或叔丁醇钾)的存在下,在惰性溶剂(如四氢呋喃、乙醚或叔丁基乙基醚)中的缩合获得。以上所描述的具有式X的化合物(方案7)形成具有式X-1的化合物(其中Ra是氢)的特定亚组。

[0395] 可替代地,具有式XIII的化合物可以通过具有式XIV的化合物(其中R_2、G和X_1如式I中所定义,并且其中Ra是氢或C_1-C_4烷基,并且R_c是氯或C_1-C_4烷氧基(优选地甲氧基或乙氧

基))与具有式$R_7C(O)CH_3$的试剂或具有式$R_7C(O)CH_2C(O)R_d$的试剂(其中R_7是氢或C_1-C_4烷基并且R_d是甲基或C_1-C_4烷氧基(优选地甲氧基或乙氧基))在如以上所描述的或由本领域技术人员充分选择的类似条件下的缩合获得。此类条件已经描述于文献,例如J.Med.Chem.[药物化学杂志]33,1859-1865(1990)中。

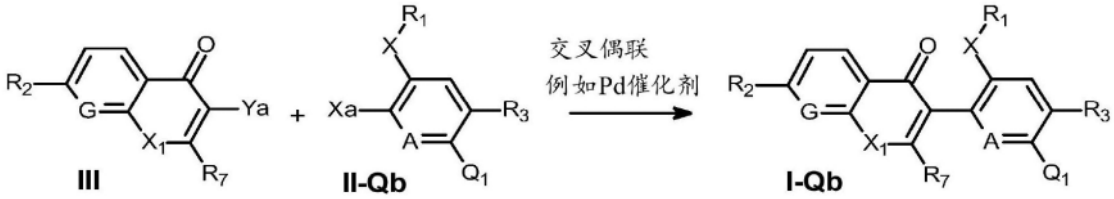
[0396] 具有式X-1的化合物,其中R_2、G和X_1如式I中所定义,并且其中Ra是氢或C_1-C_4烷基(包括具有式X的化合物,其中R_2、G和X_1如式I中所定义);以及

[0397] 具有式XIV的化合物(其中R_2、G和X_1如式I中所定义,并且其中Ra是氢或C_1-C_4烷基,并且R_c是氯或C_1-C_4烷氧基(优选地甲氧基或乙氧基));

[0398] 是已知的、可商购的或可以通过本领域技术人员已知的方法来制备。

[0399] 具有式I的化合物(其中R_2、G、X_1和R_7如式I中所定义并且其中Q被定义为Qb,其中Q_1、R_3、X、A和R_1如式I中所定义)的亚组可以被定义为具有式I-Qb的化合物。

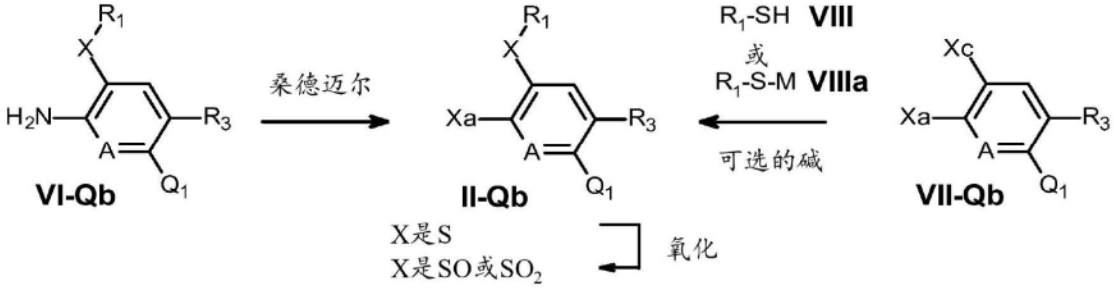
[0400] 方案10

[0401] 

[0402] 先前在方案3中所描述的由具有式III的化合物和具有式II-Qa的化合物得到具有式I-Qa的化合物的化学反应可以类似地应用于由具有式III的化合物和具有式II-Qb的化合物制备具有式I-Qb的化合物(方案10),其中先前所提及的所有取代基定义仍然有效。

[0403] 先前在方案6中所描述的由具有式VI-Qa的化合物或具有式VII-Qa的化合物得到具有式II-Qa的化合物的化学反应可以类似地应用于由具有式VI-Qb的化合物或具有式VII-Qb的化合物制备具有式II-Qb的化合物(方案11),其中先前所提及的所有取代基定义仍然有效。

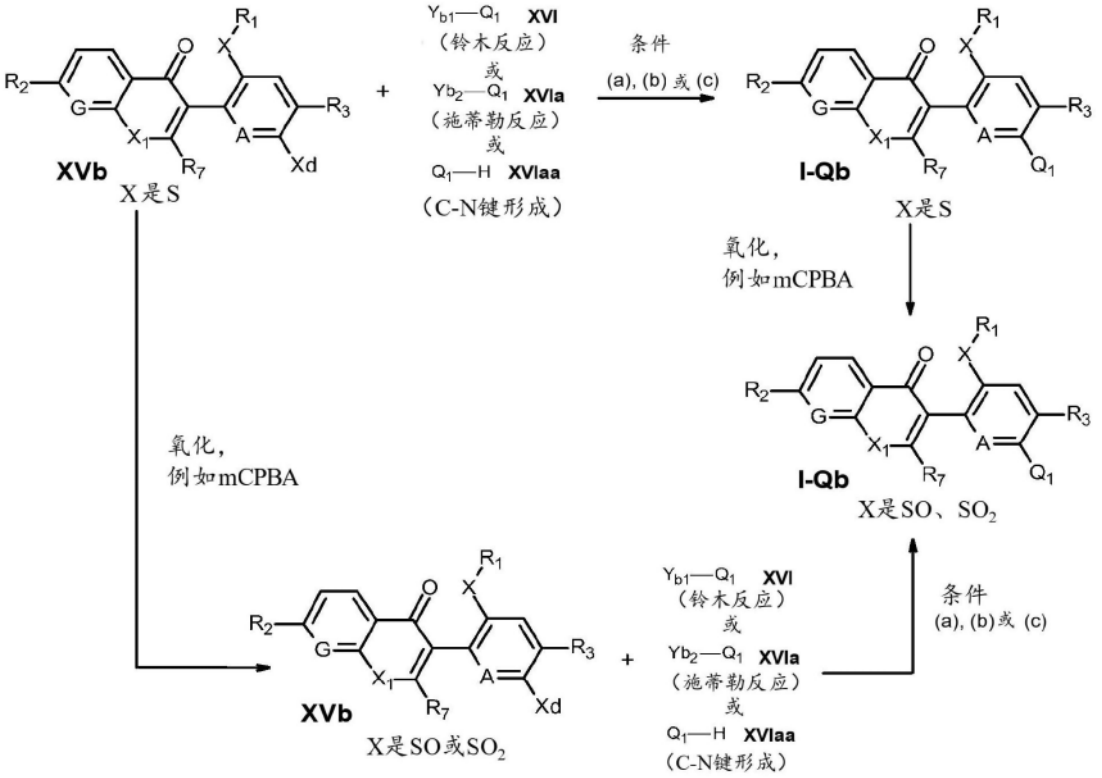
[0404] 方案11

[0405] 

[0406] 可替代地,具有式I-Qb的化合物(其中Q_1、R_3、X、A、R_1、R_2、G、X_1和R_7如式I中所定义)可以如方案12中所示制备。

[0407] 方案12

[0408]



(a) 铃木反应：Pd催化剂（例如$Pd(PPh_3)_4$或$Pd(dppf)Cl_2$，碱（例如Na_2CO_3），溶剂（例如1,2-二甲氧基乙烷/水），25° C-180° C
(b) 施蒂勒反应：Pd催化剂（例如$Pd(PPh_3)_4$或$Pd(PPh_3)Cl_2$），溶剂（例如甲苯），25° C-180° C
(c) C-N键形成：可选的碱（例如K_2CO_3或Cs_2CO_3），可选的存在铜或钯催化剂，可选的添加剂（如N,N'-二甲基乙二胺），可选的配体（如Xantphos），溶剂（例如二噁烷、吡啶或N,N-二甲基甲酰胺DMF），25℃-180℃。

[0409] 在方案12内的特定情况中，当Q_1是经由环氮原子连接至含有基团A的环的可选地取代的三唑时，则具有式I-Qb的化合物（其中X是SO或SO_2）可以由具有式XVb的化合物（其中R_3、X、A、R_1、R_2、G、X_1和R_7如式I中所定义，并且其中X是SO或SO_2，并且其中Xd是离去基团，像例如氯、溴或碘（优选地氯或溴），或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯如三氟甲磺酸酯）通过与可选地取代的三唑Q_1-H（其含有合适的NH官能度）（XVIaa）（其中Q_1是N-连接的三唑基），在溶剂（如醇（例如，甲醇、乙醇、异丙醇、或高沸点的直链或支链醇）、吡啶或乙酸）中，可选地在另外的碱（如碳酸钾K_2CO_3或碳酸铯Cs_2CO_3）的存在下，可选地在铜催化剂（例如碘化铜（I））的存在下，在30℃-180℃之间的温度下，可选地在微波辐射下的反应（C-N键形成）来制备。

[0410] 在方案12内的特定情况中，当Q_1是-N(R_4)COR_5（其中R_4和R_5如式I中所定义）时，则具有式I-Qb的化合物（其中X是SO或SO_2）可以由具有式XVb的化合物（其中R_3、X、A、R_1、R_2、G、X_1和R_7如以上式I中所定义，并且其中X是SO或SO_2，并且其中Xd是离去基团，像例如氯、溴或碘（优选地氯或溴），或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯如三氟甲磺酸酯）通过与试剂Q_1-H（XVIaa）（相当于HN(R_4)COR_5，其中R_4和R_5如式I中所定义）的反应（C-N键形成）来制备。此种反应是在碱（如碳酸钾、碳酸铯、氢氧化钠）的存在下，在惰性溶剂（如甲苯、二甲基甲酰胺DMF、N-甲基吡咯烷NMP、二甲亚砜DMSO、二噁烷、四氢呋喃THF等）中，可选地在催化剂（例如乙酸钯（II）、双（二亚苄基丙酮）钯（0）（Pd(dba)$_2$）或三（二亚苄基丙酮）二钯（0）（Pd_2(dba)$_3$），可选地以氯仿加合物的形式）或钯预催化剂（例如像tert-BuBrettPhos Pd G3[(2-二-叔丁基膦基-3,6-二甲氧基-2',4',6'-三异丙基-1,1'-联苯基)-2-(2'-氨基-1,1'-联苯基)]甲磺酸钯（II）或BrettPhos Pd G3[(2-二-环己基膦基-3,6-二甲氧基-2',4',6'-三异丙基-1,1'-联苯基)-2-(2'-氨基-1,1'-联苯基)]甲磺酸钯（II））的存在下，并且可选地在配体（例如SPhos、

t-BuBrettPhos或Xantphos)的存在下,在60℃-120℃之间的温度下,可选地在微波辐射下进行。

[0411] 在方案12内的特定情况中,当Q_1是-N(R_4)$_2$(其中R_4如式I中所定义)时,则具有式I-Qb的化合物(其中X是SO或SO_2)可以由具有式XVb的化合物(其中R_3、X、A、R_1、R_2、G、X_1和R_7如以上式I中所定义,并且其中X是SO或SO_2,并且其中Xd是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选地氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯如三氟甲磺酸酯)通过与试剂Q_1-H(XVIaa)(相当于HN(R_4)$_2$)或其盐(如氢卤化物盐,优选地盐酸盐或氢溴酸盐、或三氟乙酸盐、或任何其他等效盐)(其中R_4如式I中所定义)反应(C-N键形成)来制备。此种反应通常在惰性溶剂(如醇、酰胺、酯、醚、腈以及水,特别优选的是甲醇、乙醇、2,2,2-三氟乙醇、丙醇、异丙醇、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二噁烷、四氢呋喃、二甲氧基乙烷、乙腈、乙酸乙酯、甲苯、水或其混合物)中,在0℃-150℃之间的温度下,可选地在微波辐射下或使用高压釜的加压条件下,可选地在铜催化剂(如铜粉、碘化铜(I)或硫酸铜(可选地呈水合物的形式)或其混合物)的存在下,可选地在配体(例如二胺配体(例如,N,N′-二甲基乙二胺或反式-环己基二胺)或二亚苄基丙酮(dba)或1,10-菲咯啉)的存在下,并且可选地在碱(如磷酸钾)的存在下进行。

[0412] 试剂HN(R_4)$_2$或HN(R_4)COR_5(其中R_4和R_5如在式I中所定义)是已知的、可商购的或者可以通过本领域技术人员已知的方法制备。

[0413] 可替代地,具有式I-Qb的化合物(其中X是SO或SO_2)可以通过铃木反应来制备,该反应涉及例如使具有式XVb的化合物(其中R_3、X、A、R_1、R_2、G、X_1和R_7如以上式I中所定义,并且其中X是SO或SO_2,并且其中Xd是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选地氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯如三氟甲磺酸酯)与具有式(XVI)的化合物(其中Q_1如式I中所定义,并且其中Y_{b1}可以是硼衍生的官能团,例如像B(OH)$_2$或B(OR_{b1})$_2$,其中R_{b1}可以是C_1-C_4烷基或这两个基团OR_{b1}可以与硼原子一起形成五元环,如例如频哪醇硼酸酯)反应。该反应可以被钯基催化剂(例如四(三苯基膦)钯(0)、(1,1'双(二苯基膦基)二茂铁)二氯-钯-二氯甲烷(1:1络合物)或氯(2-二环己基膦基-2',4',6'-三异丙基-1,1'-联苯基)[2-(2'-氨基-1,1'-联苯基)]钯(II)(XPhos环钯配合物))在碱(像碳酸钠、磷酸三钾或氟化铯)的存在下,在溶剂或溶剂混合物(像例如二噁烷、乙腈、N,N-二甲基-甲酰胺、1,2-二甲氧基乙烷和水的混合物或二噁烷/水的混合物、或甲苯/水的混合物)中,优选地在惰性气氛下催化。反应温度可以优选地在从室温至反应混合物的沸点的范围内,或者该反应可以在微波辐射下进行。此类铃木反应是本领域技术人员熟知的,并且已综述于例如J.Organomet.Chem.[有机金属化学杂志]576,1999,147-168中。

[0414] 可替代地,具有式I-Qb的化合物(其中X是SO或SO_2)可以通过具有式(XVIa)的化合物(其中Q_1如以上所定义,并且其中Y_{b2}是三烷基锡衍生物、优选地三正丁基锡或三甲基锡)与具有式XVb的化合物(其中R_3、X、A、R_1、R_2、G、X_1和R_7如以上式I中所定义,并且其中X是SO或SO_2,并且其中Xd是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选地氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯如三氟甲磺酸酯)之间的施蒂勒反应来制备。此类施蒂勒反应通常是在钯催化剂(例如四(三苯基膦)钯(0)或双(三苯基膦)二氯化钯(II))的存在下,在惰性溶剂(如N,N-二甲基甲酰胺、乙腈、甲苯或二噁烷)中,任选地在添加剂(如氟化铯或氯化锂)的存在下,并且任选地在另外的催化剂(例如碘化铜(I))的存在下进行。此类施蒂勒偶联也是本领域技术人员熟知的,并且已经例如描述于J.Org.Chem.[有机化学杂志],2005,70,8601-8604;

J.Org.Chem.[有机化学杂志],2009,74,5599-5602;以及Angew.Chem.Int.Ed.[应用化学国际版],2004,43,1132-1136中。

[0415] 当Q_1是经由环氮原子连接至含有取代基A的环的五元芳香族环体系时,则具有式I-Qb的化合物(其中X是SO或SO_2)可以由具有式XVb的化合物(其中R_3、X、A、R_1、R_2、G、X_1和R_7如以上式I中所定义,并且其中X是SO或SO_2,并且其中Xd是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选地氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯如三氟甲磺酸酯)通过与杂环Q_1-H(其含有适当的NH官能度)(XVIaa)(其中Q_1如以上所定义)在碱(如碳酸钾K_2CO_3或碳酸铯Cs_2CO_3)的存在下,可选地在铜催化剂(例如,碘化铜(I))的存在下,在具有或不具有添加剂(如L-脯氨酸、N,N'-二甲基环己烷-1,2-二胺或N,N'-二甲基-亚乙基-二胺)的情况下,在惰性溶剂(如N-甲基吡咯烷酮NMP或N,N-二甲基甲酰胺DMF)中,在30℃-150℃之间的温度下,可选地在微波辐射下反应来制备。

[0416] 将具有式XVb的化合物(其中R_3、X、A、R_1、R_2、G、X_1和R_7如以上式I中所定义,并且其中X是S,并且其中Xd是离去基团,像例如氯、溴或碘(优选地氯或溴),或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯如三氟甲磺酸酯)用合适的氧化剂氧化成具有式XVb的化合物(其中X是SO或SO_2)可以在以上已经描述的条件下实现。

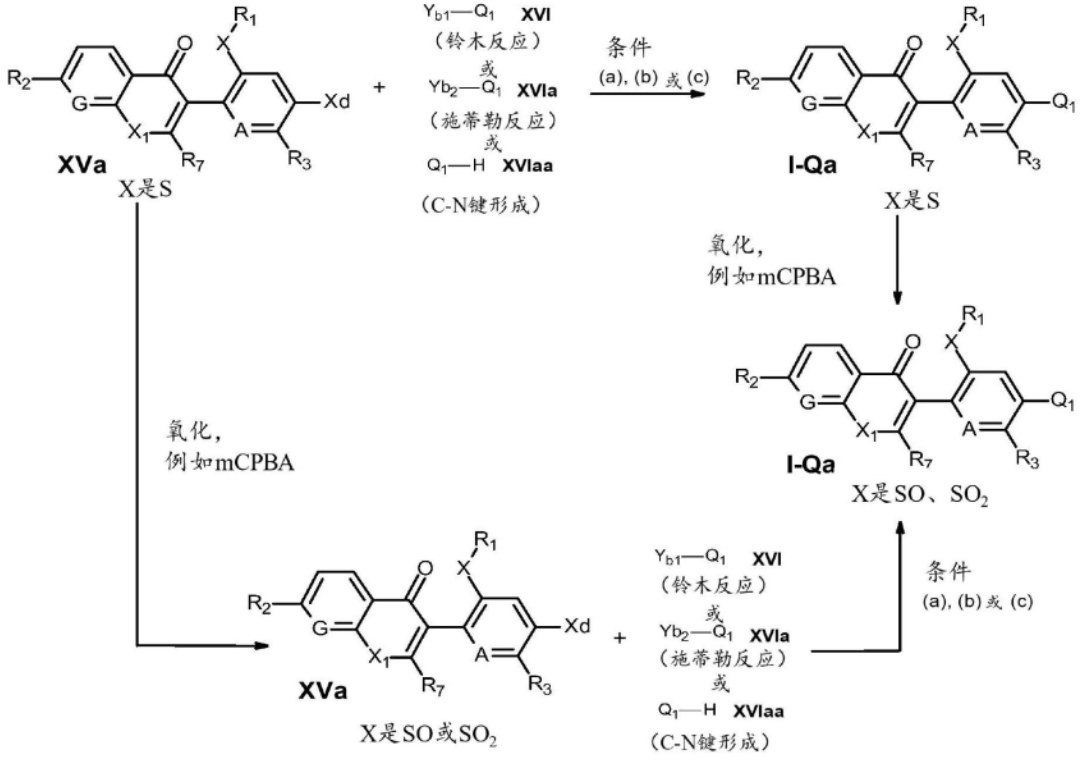
[0417] 大量的具有式(XVI)、(XVIa)和(XVIaa)的化合物是可商购的或可以由本领域技术人员制备。

[0418] 可替代地,具有式I-Qb的化合物(其中X是SO或SO_2)可以由具有式XVb的化合物(其中X是S(硫化物))通过涉及如以上所述的相同的化学过程,但通过改变步骤的顺序(即,通过运行顺序XVb(X是S)至I-Qb(X是S)经由铃木、施蒂勒或C-N键形成,随后是氧化步骤以形成I-Qb(X是SO或SO_2))来制备。

[0419] 先前在方案12中所述的由具有式XVb的化合物得到具有式I-Qb的化合物的化学过程可以类似地应用于由具有式XVa的化合物制备具有式I-Qa的化合物(方案13),其中先前提到的所有取代基定义仍然有效。

[0420] 方案13

[0421]

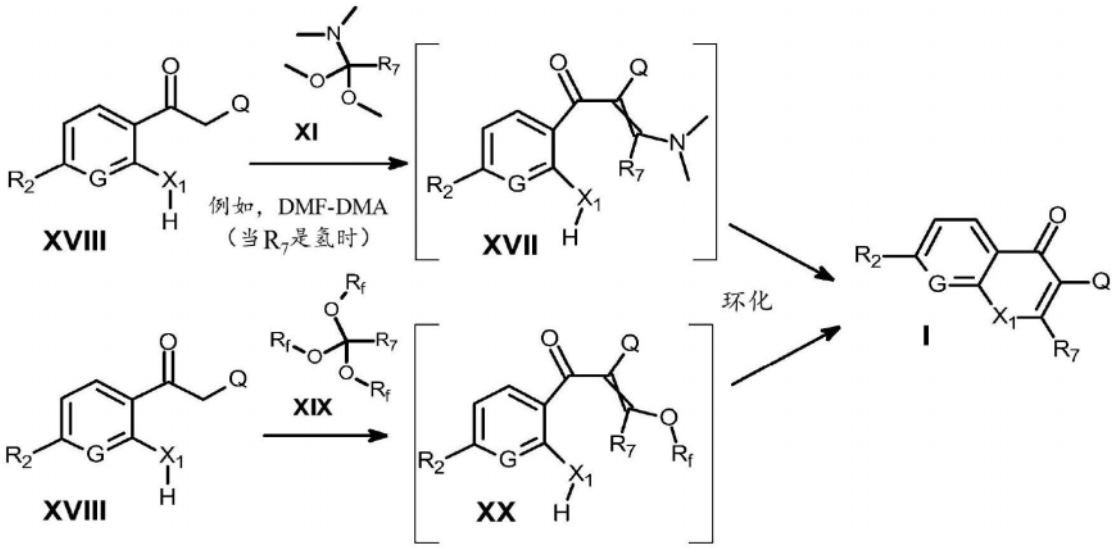


(a) 铃木反应：Pd催化剂（例如$Pd(PPh_3)_4$或$Pd(dppf)Cl_2$，碱（例如Na_2CO_3），溶剂（例如1,2-二甲氧基乙烷/水），25°C-180°C
(b) 施蒂勒反应：Pd催化剂（例如$Pd(PPh_3)_4$或$Pd(PPh_3)Cl_2$），溶剂（例如甲苯），25°C-180°C
(c) C-N键形成：可选的碱（例如K_2CO_3或Cs_2CO_3），可选的存在铜或钯催化剂，可选的添加剂（如N,N'-二甲基乙二胺），可选的配体（如Xantphos），溶剂（例如二噁烷、吡啶或N,N-二甲基甲酰胺DMF），25°C-180°C。

[0422] 可替代地,具有式I的化合物(其中Q、R_2、G和X_1如式I中所定义,并且R_7是氢或C_1-C_4烷基),

[0423] 方案14

[0424]



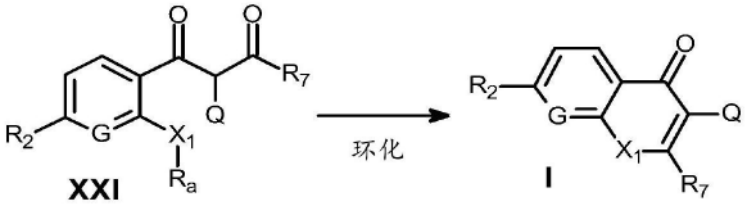
[0425] 可以通过使具有式XVIII的化合物(其中Q(在本方案14中,Qa、相应地Qb中的箭头指示与羰基的邻位碳原子的附接点)、R_2、G和X_1如式I中所定义)与具有式XI的试剂(其中R_7是氢或C_1-C_4烷基)在用于将具有式X的化合物转化成具有式IX的化合物的方案7中已经描述的类似条件下反应来制备(方案14)。典型地,具有式XI的试剂是例如N,N-二甲基甲酰胺二甲基乙缩醛DMF-DMA(R_7是H)或1,1-二甲氧基-N,N-二甲基-乙胺(R_7是甲基)。过程XVIII+XI

在此类条件下允许直接形成具有式I的化合物而不分离可能的具有式XVII的中间体化合物,其中Q、R_2、G和X_1如式I中所定义并且R_7是氢或C_1-C_4烷基。此类环化条件已经描述于文献,例如WO 2015/047113中。

[0426] 类似地,具有式I的化合物(其中Q、R_2、G和X_1如式I中所定义并且R_7是氢或C_1-C_4烷基)可以通过使具有式XVIII的化合物(其中Q、R_2、G和X_1如式I中所定义)与具有式XIX的试剂(其中R_7是氢或C_1-C_4烷基并且其中R_f是C_1-C_4烷基)优选地在添加剂(可选地以催化剂量)(如吡啶、哌啶、吗啉或4-二甲基氨基吡啶(DMAP))的存在下,可选地在稀释剂(如N,N-二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺、甲苯或二甲苯)的存在下,在50℃与180℃之间的温度下、优选地在范围从80℃至反应混合物的沸点的温度下反应来制备(方案14)。典型地,具有式XIX的试剂是例如原甲酸三乙酯(R_7是氢并且R_f是乙基)。过程XVIII+XIX在此类条件下允许直接形成具有式I的化合物而不分离可能的具有式XX的中间体化合物,其中Q、R_2、G和X_1如式I中所定义,R_7是氢或C_1-C_4烷基并且其中R_f是C_1-C_4烷基。此类环化条件已经描述于文献,例如J.Chem Research[化学研究杂志](12),683-685(2008)中。

[0427] 可替代地,具有式I的化合物(其中Q、R_2、G和X_1如式I中所定义,并且R_7是氢或C_1-C_4烷基),

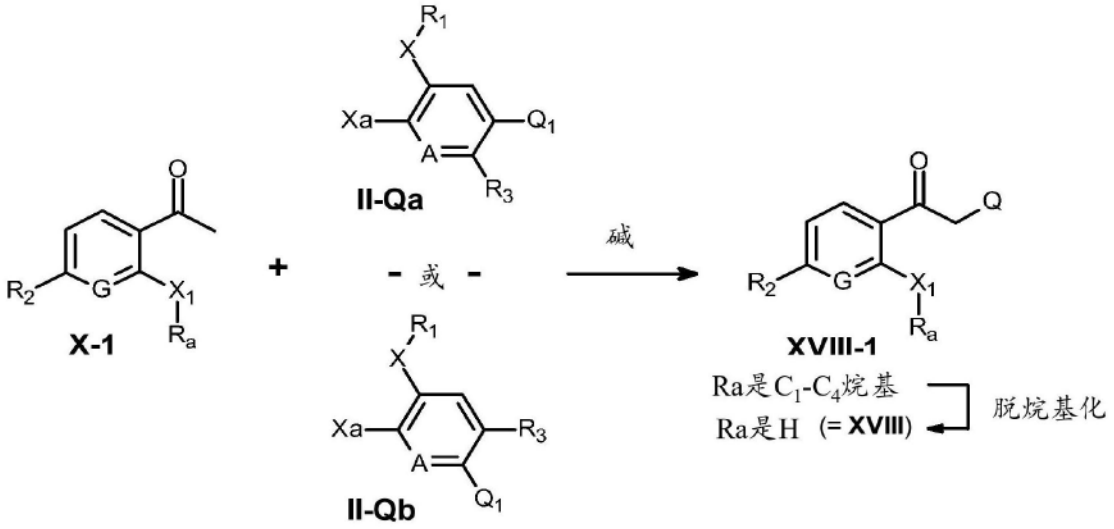
[0428] 方案15

[0429] 

[0430] 可以通过使具有式XXI的化合物(其中Q(在本方案15中,Qa、相应地Qb中的箭头指示与羰基的邻位碳原子的附接点)、R_2、G和X_1如式I中所定义并且R_7是氢或C_1-C_4烷基,并且其中Ra是氢或C_1-C_4烷基)在用于将具有式XIII的化合物转化成具有式XII的化合物的方案8中已经详述的类似条件下环化来制备(方案15)。其他此类环化条件也已经描述于文献,例如WO 2007/065888或Eur.J.Org.Chem.[欧洲有机化学杂志]2971-2983(2019)中。

[0431] 具有式XVIII的化合物(其中Q(在本方案18中,Qa、相应地Qb中的箭头指示与羰基的邻位碳原子的附接点)、R_2、G和X_1如式I中所定义),

[0432] 方案16

[0433] 

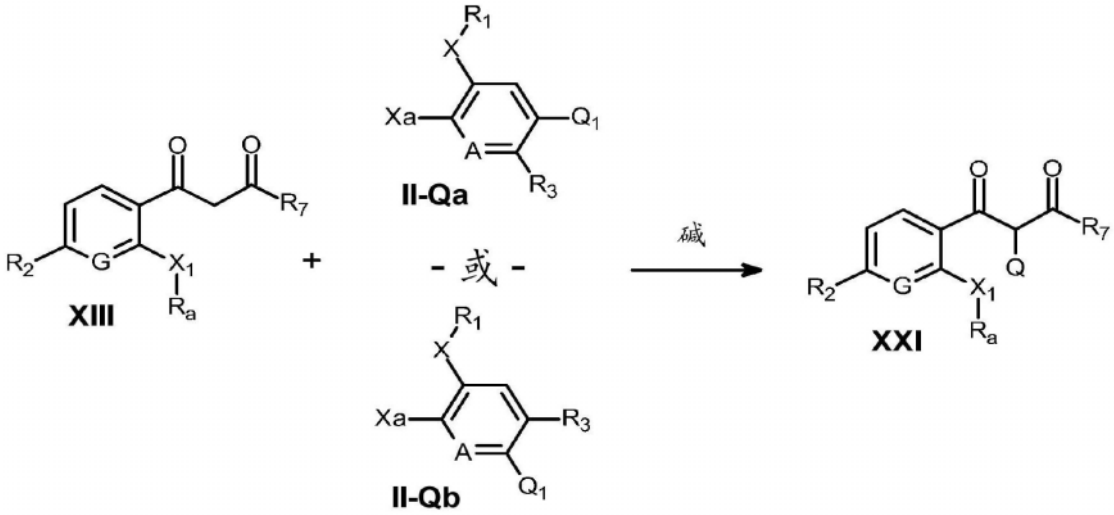
[0434] 可以通过具有式XVIII-1的化合物(其中Q、R_2、G和X_1如式I中所定义,并且其中Ra是C_1-C_4烷基)在试剂如三溴化硼或氯化铝的存在下,在溶剂如二氯甲烷或1,2-二氯乙烷中,以及在范围从-78℃至室温的温度下,在本领域技术人员已知并且描述于例如J Med Chem[药物化学杂志]61,7917-7928(2018)中的条件下的脱烷基化来制备(方案16)。

[0435] 具有式XVIII-1的化合物(其中Q、R_2、G和X_1如式I中所定义,并且其中Ra是氢或C_1-C_4烷基(包括具有式XVIII的化合物,其中Q、R_2、G和X_1如式I中所定义))可以通过使具有式X-1的化合物(其中R_2、G和X_1如式I中所定义,并且其中Ra是氢或C_1-C_4烷基(包括具有式X的化合物,其中R_2、G和X_1如式I中所定义))与具有式II-Qa或II-Qb的化合物(其中Q_1、R_3、X、A和R_1如式I中所定义,并且其中Xa是离去基团,像例如氯、溴或碘,或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯如三氟甲磺酸酯),在碱(如碳酸钾或碳酸铯、氢化钠、甲醇钠、乙醇钠或叔丁醇钾)的存在下,在惰性溶剂(如四氢呋喃、叔丁基乙基醚、乙腈、二甲基亚砜或N,N-二甲基甲酰胺)中,以及在范围在0℃至80℃之间、优选地在20℃与反应混合物的沸点之间的温度下反应来制备。此类条件已经描述于文献,例如Tetrahedron Letters[四面体快报]54,402-405(2013)中。使X-1与II-Qa反应提供XVIII-1,其中Q是Qa;类似地,使X-1与II-Qb反应提供XVIII-1,其中Q是Qb。

[0436] 可替代地,具有式XVIII-1的化合物(其中Q、R_2、G和X_1如式I中所定义,并且其中Ra是氢或C_1-C_4烷基)可以通过使具有式X-1的化合物(其中R_2、G和X_1如式I中所定义,并且其中Ra是氢或C_1-C_4烷基)与具有式II-Qa或II-Qb的化合物(其中Q_1、R_3、X、A和R_1如式I中所定义,并且其中Xa是离去基团,像例如氯、溴或碘,或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯如三氟甲磺酸酯),在催化剂(例如乙酸钯(II)、氯化钯(II)、双(二亚苄基丙酮)钯(0)($Pd(dba)_2$)或三(二亚苄基丙酮)-二钯(0)($Pd_2(dba)_3$,可选地呈氯仿加合物的形式)的存在下,在配体(例如三苯基膦、BINAP或Xantphos)的存在下,在碱(如叔丁醇钠或叔丁醇钾、碳酸铯或碳酸钾)的存在下,在惰性溶剂(如四氢呋喃、甲苯或二噁烷)的存在下,以及在60℃-120℃之间的温度下,可选地在微波辐射下反应来制备。此类条件已经描述于文献,例如WO 2016/097073、CN 109956928或Angew Chem Int Ed[应用化学国际版]53,1529-1533(2014)中。

[0437] 具有式XXI的化合物(其中Q(在本方案17中,Qa、相应地Qb中的箭头指示与羰基的邻位碳原子的附接点),R_2、G和X_1如式I中所定义并且R_7是氢或C_1-C_4烷基,并且其中Ra是氢或C_1-C_4烷基),

[0438] 方案17

[0439] 

[0440] 可以通过使具有式XIII的化合物(其中R_2、G和X_1如式I中所定义,并且R_7是氢或C_1-C_4烷基,并且其中Ra是氢或C_1-C_4烷基)与具有式II-Qa或II-Qb的化合物(其中Q_1、R_3、X、A和R_1如式I中所定义,并且其中Xa是离去基团,像例如氯、溴或碘,或芳基磺酸酯或烷基磺酸酯如三氟甲磺酸酯),在碱(如二异丙基酰胺锂、双(三甲基甲硅烷基)酰胺钾、甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钾或氢化钠)的存在下,可选地在铜或钯催化下,在惰性溶剂(如四氢呋喃、叔丁基乙基醚或N,N-二甲基甲酰胺)中,以及在0℃至80℃之间的温度下反应来制备(方案17)。使XIII与II-Qa反应提供XXI,其中Q是Qa;类似地,使XIII与II-Qb反应提供XXI,其中Q是Qb。

[0441] 反应物可以在碱的存在下反应。合适的碱的实例是碱金属或碱土金属氢氧化物、碱金属或碱土金属氢化物、碱金属或碱土金属酰胺、碱金属或碱土金属醇盐、碱金属或碱土金属乙酸盐、碱金属或碱土金属碳酸盐、碱金属或碱土金属二烷基酰胺或碱金属或碱土金属烷基甲硅烷基酰胺、烷基胺、亚烷基二胺、游离的或N-烷基化的饱和或不饱和的环烷基胺、碱性杂环、氢氧化铵和碳环胺。可以提及的实例是氢氧化钠、氢化钠、氨基钠、甲醇钠、乙酸钠、碳酸钠、叔丁醇钾、氢氧化钾、碳酸钾、氢化钾、二异丙氨基锂、双(三甲基硅烷基)酰胺钾、氢化钙、三乙胺、二异丙基乙胺、三亚乙基二胺、环己胺、N-环己基-N,N-二甲胺、N,N-二乙基苯胺、吡啶、4-(N,N-二甲基氨基)吡啶、奎宁环、N-甲基吗啉、苄基三甲基铵氢氧化物和1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯(DBU)。

[0442] 这些反应物可以按原样彼此进行反应,即不添加溶剂或稀释剂。然而,在大多数情况下,添加惰性溶剂或稀释剂或这些的混合物是有利的。如果该反应在碱的存在下进行,则过量采用的碱(如三乙胺、吡啶、N-甲基吗啉或N,N-二乙基苯胺)还可以充当溶剂或稀释剂。

[0443] 这些反应有利地在从大约-80℃至大约+140℃、优选地从大约-30℃至大约+100℃的温度范围内,在许多情况下在环境温度与大约+80℃之间的范围内进行。

[0444] 通过以常规方式用根据本发明的(另一个)其他取代基替代具有式I的起始化合物的一个或多个取代基,并通过用本领域技术人员已知的反应(如氧化、烷基化、还原、酰化和其他方法)对化合物进行后修饰,可以将具有式I的化合物以本身已知的方式转化成另一种具有式I的化合物。

[0445] 取决于适合各自情况的反应条件和起始材料的选择,有可能例如在一个反应步骤中仅将一个取代基用根据本发明的另一个取代基替代,或在同一个反应步骤中可以将多个

取代基用根据本发明的其他取代基来替代。

[0446] 具有式I的化合物的盐可以以本身已知的方式来制备。因此,例如,具有式I的化合物的酸加成盐是通过用合适的酸或合适的离子交换剂试剂进行处理来获得的,并且与碱的盐是通过用合适的碱或用合适的离子交换剂试剂进行处理来获得的。

[0447] 具有式I的化合物的盐能够以常规方式转化成游离化合物I、酸加成盐(例如通过用合适的碱性化合物或用合适的离子交换剂试剂进行处理)以及与碱的盐(例如通过用合适的酸或用合适的离子交换剂试剂进行处理)。

[0448] 具有式I的化合物的盐能够以本身已知的方式转化成具有式I的化合物的其他盐、酸加成盐,例如转化成其他酸加成盐,例如通过在合适的溶剂中用酸的合适的金属盐(如钠、钡或银的盐,例如用乙酸银)来处理无机酸的盐(如盐酸盐),在该溶剂中,所形成的无机盐(例如氯化银)是不溶的并且因此从该反应混合物中沉淀出。

[0449] 取决于程序或反应条件,具有成盐特性的这些具有式I的化合物能够以游离形式或以盐的形式获得。

[0450] 取决于分子中存在的不对称碳原子的数目、绝对和相对构型和/或取决于分子中存在的非芳香族双键的构型,具有式I的化合物和适当时其互变异构体(在每种情况下以游离形式或以盐形式)能够以可能的异构体之一的形式或作为这些的混合物存在,例如以纯异构体的形式,如对映体和/或非对映体,或作为异构体混合物,如对映异构体混合物,例如外消旋体、非对映体混合物或外消旋体混合物存在;本发明涉及纯异构体以及还有所有可能的异构体混合物,并且在上文和下文中在每种情况下都应如此理解,即使立体化学细节未在每种情况下明确提及。

[0451] 以游离形式或以盐形式的具有式I的化合物的非对映异构体混合物或外消旋体混合物(它们的获得可以取决于已选择的起始材料和程序)可以在这些组分的物理化学差异的基础上,例如通过分步结晶、蒸馏和/或色谱法以已知的方式分离成纯的非对映异构体或外消旋体。

[0452] 能够以类似方式获得的对映异构体混合物(如外消旋体)可以通过已知方法拆分成光学对映体,例如通过从光学活性溶剂再结晶;通过在手性吸附剂上的色谱法,例如在乙酰纤维素上的高效液相色谱法(HPLC);借助于适合的微生物,通过用特异性固定化酶裂解;通过形成包络化合物,例如使用手性冠醚,其中仅一个对映异构体被络合;或通过转化成非对映异构体的盐,例如通过使碱性最终产物外消旋体与光学活性酸(如羧酸,例如樟脑酸、酒石酸或苹果酸,或磺酸,例如樟脑磺酸)反应,并且分离能够以此方式获得的非对映异构体混合物,例如基于其不同溶解度通过分步结晶,从而获得非对映异构体,从该非对映异构体可以通过适合的试剂(例如碱性试剂)的作用使所希望的对映异构体变成游离的。

[0453] 纯的非对映异构体或对映异构体可以根据本发明来获得,不仅是通过分离合适的异构体混合物,还可以是通过普遍已知的非对映立体选择性或对映选择性合成的方法,例如通过根据本发明用具有合适的立体化学的起始材料进行该方法。

[0454] 可以通过使具有式I的化合物与合适的氧化剂(例如H_2O_2/脲加合物)在酸酐(例如三氟乙酸酐)的存在下进行反应来制备N-氧化物。此类氧化从文献中,例如从J.Med.Chem.[药物化学杂志],32(12),2561-73,1989或WO 2000/15615中是已知的。

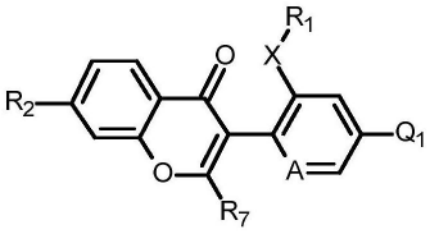
[0455] 如果单个组分具有不同的生物活性,则有利的是在每种情况下分离或合成生物学

上更有效的异构体,例如对映异构体或非对映异构体或异构体混合物,例如对映异构体混合物或非对映异构体混合物。

[0456] 如果适当的话,具有式I的化合物和适当时其互变异构体(在每种情况下以游离形式或以盐形式)也能够以水合物的形式获得和/或包括其他溶剂,例如可以用于使以固体形式存在的化合物结晶的那些。

[0457] 根据下表A-1至A-36、表B-1至B-36、表C-1至C-36和表D-1至D-36的化合物可以根据上述方法制备。以下实例旨在说明本发明并且示出优选的具有式I的化合物。

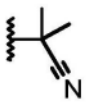
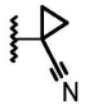
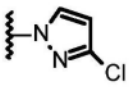
[0458] 下表A-1至A-36说明了本发明的特定化合物。

[0459]  **(Ia-Qa)**

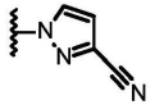
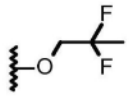
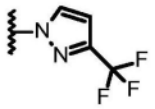
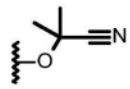
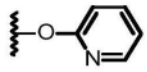
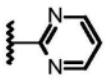
[0460] 表A-1提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-1.001至A-1.020,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0461] 表Y:Q_1的取代基定义

[0462]

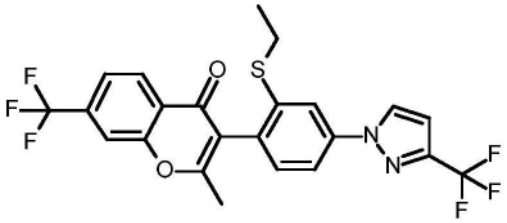
索引	Q_1	索引	Q_1
1	H	11	
2	$-N(CH_3)COCH_3$	12	
3	$-N(CH_3)COCH_2CH_3$	13	
4	$-N(CH_3)COcycloC3$	14	
5	CF_3	15	
6		16	

[0463]

索引	Q_1	索引	Q_1
7	OCH_2CF_3	17	
8		18	
9		19	
10		20	

[0464] 在表Y和表A中,“环C3”表示环丙基。

[0465] 例如,化合物A-10.018是

[0466] 

[0467] 表A-2提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-2.001至A-2.020,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0468] 表A-3提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-3.001至A-3.020,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0469] 表A-4提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-4.001至A-4.020,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0470] 表A-5提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-5.001至A-5.020,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0471] 表A-6提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-6.001至A-6.020,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0472] 表A-7提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-7.001至A-7.020,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0473] 表A-8提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-8.001至A-8.020,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0474] 表A-9提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-9.001至A-9.020,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0475] 表A-10提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-10.001至A-10.020,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0476] 表A-11提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-11.001至A-11.020,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0477] 表A-12提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-12.001至A-12.020,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0478] 表A-13提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-13.001至A-13.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0479] 表A-14提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-14.001至A-14.019,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0480] 表A-15提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-15.001至A-15.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0481] 表A-16提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-16.001至A-16.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0482] 表A-17提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-17.001至A-17.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0483] 表A-18提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-18.001至A-18.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0484] 表A-19提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-19.001至A-19.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0485] 表A-20提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-20.001至A-20.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0486] 表A-21提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-21.001至A-21.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0487] 表A-22提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-22.001至A-22.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0488] 表A-23提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-23.001至A-23.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0489] 表A-24提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-24.001至A-24.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0490] 表A-25提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-25.001至A-25.020,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0491] 表A-26提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-26.001至A-26.020,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0492] 表A-27提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-27.001至A-27.020,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0493] 表A-28提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-28.001至A-28.020,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0494] 表A-29提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-29.001至A-29.020,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0495] 表A-30提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-30.001至A-30.020,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0496] 表A-31提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-31.001至A-31.020,其中R_2是OCF_3,R_7

是CH_3,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0497] 表A-32提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-32.001至A-32.020,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

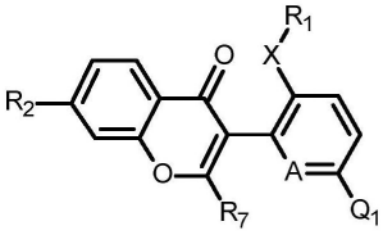
[0498] 表A-33提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-33.001至A-33.020,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0499] 表A-34提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-34.001至A-34.020,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0500] 表A-35提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-35.001至A-35.020,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0501] 表A-36提供了20种具有式Ia-Qa的化合物A-36.001至A-36.020,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0502] 下表B-1至B-36进一步说明了本发明的具体化合物。

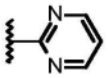
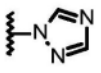
[0503] 

(Ia-Qb)

[0504] 表B-1提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-1.001至B-1.012,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0505] 表Z:Q_1的取代基定义

[0506]

索引	Q_1	索引	Q_1
1	H	7	$-NH_2$
2	$-N(CH_3)COCH_3$	8	$-NH(CH_3)$
3	$-N(CH_3)COCH_2CH_3$	9	$-NHCOCH_3$
4	-N(CH3)COcycloC3	10	$-NHCOCH_2CH_3$
5		11	-NHCOcycloC3
6		12	

[0507] 在表Z和表B中,“环C3”表示环丙基。

[0508] 表B-2提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-2.001至B-2.012,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0509] 表B-3提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-3.001至B-3.012,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0510] 表B-4提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-4.001至B-4.012,其中R_2是CF_3,R_7是H,A

是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0511] 表B-5提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-5.001至B-5.012,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0512] 表B-6提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-6.001至B-6.012,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0513] 表B-7提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-7.001至B-7.012,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0514] 表B-8提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-8.001至B-8.012,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0515] 表B-9提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-9.001至B-9.012,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0516] 表B-10提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-10.001至B-10.012,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0517] 表B-11提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-11.001至B-11.012,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0518] 表B-12提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-12.001至B-12.012,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0519] 表B-13提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-13.001至B-13.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0520] 表B-14提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-14.001至B-14.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0521] 表B-15提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-15.001至B-15.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0522] 表B-16提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-16.001至B-16.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0523] 表B-17提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-17.001至B-17.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0524] 表B-18提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-18.001至B-18.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0525] 表B-19提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-19.001至B-19.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0526] 表B-20提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-20.001至B-20.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0527] 表B-21提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-21.001至B-21.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0528] 表B-22提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-22.001至B-22.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0529] 表B-23提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-23.001至B-23.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0530] 表B-24提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-24.001至B-24.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0531] 表B-25提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-25.001至B-25.012,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0532] 表B-26提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-26.001至B-26.012,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0533] 表B-27提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-27.001至B-27.012,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0534] 表B-28提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-28.001至B-28.012,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0535] 表B-29提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-29.001至B-29.012,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0536] 表B-30提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-30.001至B-30.012,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0537] 表B-31提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-31.001至B-31.012,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0538] 表B-32提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-32.001至B-32.012,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

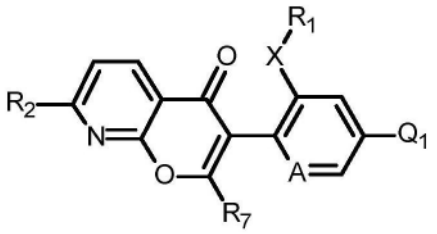
[0539] 表B-33提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-33.001至B-33.012,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0540] 表B-34提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-34.001至B-34.012,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0541] 表B-35提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-35.001至B-35.012,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0542] 表B-36提供了12种具有式Ia-Qb的化合物B-36.001至B-36.012,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0543] 下表C-1至C-36进一步说明了本发明的具体化合物。

[0544] 

(Ib-Qa)

[0545] 在表Y和表C中,“环C3”表示环丙基。

[0546] 表C-1提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-1.001至C-1.020,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0547] 表C-2提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-2.001至C-2.020,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0548] 表C-3提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-3.001至C-3.020,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0549] 表C-4提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-4.001至C-4.020,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0550] 表C-5提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-5.001至C-5.020,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0551] 表C-6提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-6.001至C-6.020,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0552] 表C-7提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-7.001至C-7.020,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0553] 表C-8提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-8.001至C-8.020,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0554] 表C-9提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-9.001至C-9.020,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0555] 表C-10提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-10.001至C-10.020,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0556] 表C-11提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-11.001至C-11.020,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0557] 表C-12提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-12.001至C-12.020,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0558] 表C-13提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-13.001至C-13.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0559] 表C-14提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-14.001至C-14.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0560] 表C-15提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-15.001至C-15.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0561] 表C-16提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-16.001至C-16.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0562] 表C-17提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-17.001至C-17.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0563] 表C-18提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-18.001至C-18.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0564] 表C-19提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-19.001至C-19.20,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0565] 表C-20提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-20.001至C-20.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0566] 表C-21提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-21.001至C-21.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0567] 表C-22提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-22.001至C-22.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0568] 表C-23提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-23.001至C-23.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7

是CH_3,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0569] 表C-24提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-24.001至C-24.020,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0570] 表C-25提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-25.001至C-25.020,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0571] 表C-26提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-26.001至C-26.020,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0572] 表C-27提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-27.001至C-27.020,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0573] 表C-28提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-28.001至C-28.020,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0574] 表C-29提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-29.001至C-29.020,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0575] 表C-30提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-30.001至C-30.020,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0576] 表C-31提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-31.001至C-31.020,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0577] 表C-32提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-32.001至C-32.020,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

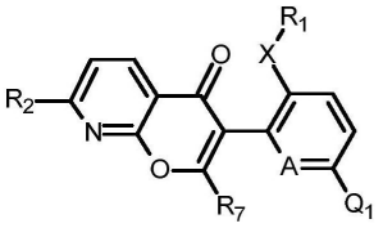
[0578] 表C-33提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-33.001至C-33.020,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0579] 表C-34提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-34.001至C-34.020,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0580] 表C-35提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-35.001至C-35.020,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0581] 表C-36提供了20种具有式Ib-Qa的化合物C-36.001至C-36.020,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Y中所定义。

[0582] 下表D-1至D-36进一步说明了本发明的具体化合物。

[0583] 

(Ib-Qb)

[0584] 在表Z和表D中,“环C3”表示环丙基。

[0585] 表D-1提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-1.001至D-1.012,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0586] 表D-2提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-2.001至D-2.012,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0587] 表D-3提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-3.001至D-3.012,其中R_2是CF_3,R_7是H,A

是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0588] 表D-4提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-4.001至D-4.012,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0589] 表D-5提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-5.001至D-5.012,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0590] 表D-6提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-6.001至D-6.012,其中R_2是CF_3,R_7是H,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0591] 表D-7提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-7.001至D-7.012,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0592] 表D-8提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-8.001至D-8.012,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0593] 表D-9提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-9.001至D-9.012,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0594] 表D-10提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-10.001至D-10.012,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0595] 表D-11提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-11.001至D-11.012,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0596] 表D-12提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-12.001至D-12.012,其中R_2是CF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0597] 表D-13提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-13.001至D-13.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0598] 表D-14提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-14.001至D-14.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0599] 表D-15提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-15.001至D-15.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0600] 表D-16提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-16.001至D-16.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0601] 表D-17提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-17.001至D-17.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0602] 表D-18提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-18.001至D-18.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是H,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0603] 表D-19提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-19.001至D-19.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0604] 表D-20提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-20.001至D-20.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0605] 表D-21提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-21.001至D-21.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0606] 表D-22提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-22.001至D-22.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0607] 表D-23提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-23.001至D-23.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0608] 表D-24提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-24.001至D-24.012,其中R_2是$OCHF_2$,R_7是CH_3,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0609] 表D-25提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-25.001至D-25.012,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0610] 表D-26提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-26.001至D-26.012,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0611] 表D-27提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-27.001至D-27.012,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0612] 表D-28提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-28.001至D-28.012,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0613] 表D-29提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-29.001至D-29.012,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0614] 表D-30提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-30.001至D-30.012,其中R_2是OCF_3,R_7是H,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0615] 表D-31提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-31.001至D-31.012,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是N,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0616] 表D-32提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-32.001至D-32.012,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是N,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0617] 表D-33提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-33.001至D-33.012,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是N,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0618] 表D-34提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-34.001至D-34.012,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是S,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0619] 表D-35提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-35.001至D-35.012,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是SO,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0620] 表D-36提供了12种具有式Ib-Qb的化合物D-36.001至D-36.012,其中R_2是OCF_3,R_7是CH_3,A是CH,X是SO_2,R_1是CH_2CH_3并且Q_1如表Z中所定义。

[0621] 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,即使是在低施用比率下,它们也具有非常有利的杀生物谱并且是温血物种、鱼和植物良好耐受的。根据本发明的活性成分作用于正常敏感的以及还有抗性的动物有害生物(如昆虫或蜱螨目的代表)的所有的或个别的发育阶段。根据本发明的活性成分的杀昆虫或杀螨活性可以本身直接表现出来,即立即或仅在过去一些时间之后(例如在蜕皮期间)发生对有害生物的破坏;或间接表现出来,例如降低产卵和/或孵化率,对应于至少50%至60%的破坏率(死亡率)的良好活性。

[0622] 以上提及的动物有害生物的实例是:

[0623] 来自蜱螨目,例如,

[0624] 下毛瘿螨属物种(Acalitus spp.)、针刺瘿螨属物种(Aculus spp)、窄瘿螨属物种(Acaricalus spp.)、瘤瘿螨属物种(Aceria spp.)、粗脚粉螨(Acarus siro)、钝眼蜱属物

种(Amblyomma spp.)、锐缘蜱属物种(Argas spp.)、牛蜱属物种(Boophilus spp.)、短须螨属物种(Brevipalpus spp.)、苔螨属物种(Bryobia spp)、上三脊瘿螨属物种(Calipitrimerus spp.)、皮螨属物种(Chorioptes spp.)、鸡皮刺螨(Dermanyssus gallinae)、表皮螨属物种(Dermatophagoides spp)、始叶螨属物种(Eotetranychus spp)、瘿螨属物种(Eriophyes spp.)、半跗线螨属物种(Hemitarsonemus spp)、璃眼蜱属物种(Hyalomma spp.)、硬蜱属物种(Ixodes spp.)、小爪螨属物种(Olygonychus spp)、钝缘蜱属物种(Ornithodoros spp.)、侧多食跗线螨(Polyphagotarsone latus)、全爪螨属物种(Panonychus spp.)、桔芸锈螨(Phyllocoptruta oleivora)、植食螨属物种(Phytonemus spp.)、多食跗线螨属物种(Polyphagotarsonemus spp)、痒螨属物种(Psoroptes spp.)、扇头蜱属物种(Rhipicephalus spp.)、根螨属物种(Rhizoglyphus spp.)、疥螨属物种(Sarcoptes spp.)、狭跗线螨属物种(Steneotarsonemus spp)、跗线螨属物种(Tarsonemus spp.)以及叶螨属物种(Tetranychus spp.);

[0625] 来自虱目,例如,

[0626] 血虱属物种(Haematopinus spp.)、长颚虱属物种(Linognathus spp.)、人虱属物种(Pediculus spp.)、瘿绵蚜属物种(Pemphigus spp.)以及根瘤蚜属物种(Phylloxera spp.);

[0627] 来自鞘翅目,例如,

[0628] 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)、金龟属(Ataenius spp)、甜菜隐食甲(Atomaria linearis)、甜菜胫跳甲(Chaetocnema tibialis)、萤叶甲属(Cerotoma spp)、宽胸叩头虫属(Conoderus spp)、根颈象属(Cosmopolites spp.)、绿花金龟(Cotinis nitida)、象虫属(Curculio spp.)、圆头犀金龟属(Cyclocephala spp)、皮蠹属(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)、美洲叶甲属(Megascelis spp)、油菜花露尾甲(Melighetes aeneus)、鳃金龟属(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.)、弧丽金龟属(Popillia spp.)、蚤跳甲属(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.)、尖隐喙象属、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.);

[0629] 来自双翅目,例如,

[0630] 伊蚊属物种(Aedes spp.)、疟蚊属物种(Anopheles spp)、高粱芒蚊(Antherigona soccata.)、橄榄果实蝇(Bactrocea oleae)、花园毛蚊(Bibio hortulanus)、迟眼蕈蚊属物种(Bradysia spp.)、红头丽蝇(Calliphora erythrocephala)、小条实蝇属物种

(Ceratitis spp.)、金蝇属物种(Chrysomyia spp.)、库蚊属物种(Culex spp.)、黄蝇属物种(Cuterebra spp.)、寡鬃实蝇属物种(Dacus spp.)、地种蝇属物种(Delia spp)、黑腹果蝇(Drosophilamelanogaster)、厕蝇属物种(Fannia spp.)、胃蝇属物种(Gastrophilus spp.)、Geomyza tripunctata、舌蝇属物种(Glossina spp.)、皮蝇属物种(Hypoderma spp.)、虱蝇属物种(Hyppobosca spp.)、斑潜蝇属物种(Liriomyza spp.)、绿蝇属物种(Lucilia spp.)、黑潜蝇属物种(Melanagromyza spp.)、家蝇属物种(Musca spp.)、狂蝇属物种(Oestrus spp.)、瘿蚊属物种(Orseolia spp.)、瑞典麦秆蝇(Oscinella frit)、藜泉蝇(Pegomyia hyoscyami)、草种蝇属物种(Phorbia spp.)、绕实蝇属物种(Rhagoletis spp)、Rivelia quadrifasciata、Scatella属物种、尖眼蕈蚊属物种(Sciara spp.)、螯蝇属物种(Stomoxys spp.)、虻属物种(Tabanus spp.)、绦虫属物种(Tannia spp.)以及大蚊属物种(Tipula spp.);

[0631] 来自半翅目,例如,

[0632] 瘤缘蝽(Acanthocoris scabrator)、拟缘蝽属(Acrosternum spp)、苜蓿盲蝽(Adelphocoris lineolatus)、土黄缘蝽(Amblypelta nitida)、海虾盾缘蝽(Bathycoelia thalassina)、土长蝽属、臭虫属、Clavigralla tomentosicollis、盲蝽属(Creontiades spp.)、可可瘤盲蝽、Dichelops furcatus、棉红蝽属、埃德萨属(Edessa spp)、美洲蝽属(Euchistus spp.)、六斑菜蝽(Eurydema pulchrum)、扁盾蝽属、茶翅蝽、具凹巨股长蝽(Horcias nobilellus)、稻缘蝽属、草盲蝽属、热带硕蚧属、卷心菜斑色蝽(Murgantia histrionic)、新长缘蝽属、烟盲蝽(Nesidiocoris tenuis)、绿蝽属、拟长蝽(Nysius simulans)、海岛蝽象、皮蝽属、壁蝽属、红猎蝽属、可可褐盲蝽、栗土蝽(Scaptocoris castanea)、黑蝽属(Scotinophara spp.)、Thyanta属、锥鼻虫属、木薯网蝽(Vatiga illudens);

[0633] 豌豆无网长管蚜(Acyrthosium pisum)、阿达格(Adalges)属物种、阿加利亚纳恩西格拉(Agalliana ensigera)、塔尔吉隆脉木虱、粉虱属物种(Aleurodicus spp.)、刺粉虱属物种(Aleurocanthus spp.)、甘蔗穴粉虱、软毛粉虱(Aleurothrixus floccosus)、甘蓝粉虱(Aleyrodes brassicae)、棉叶蝉(Amarasca biguttula)、檬果长突叶蝉、肾圆盾蚧属物种、蚜科、蚜属物种、圆盾蚧属物种(Aspidiotus spp.)、茄沟无网蚜、马铃薯/番茄木虱(Bactericera cockerelli)、小粉虱属物种、短尾蚜属物种(Brachycaudus spp.)、甘蓝蚜、喀木虱属物种、双尾蚜(Cavariella aegopodii Scop.)、蜡蚧属物种、黑褐圆盾蚧、橙褐圆盾蚧、大叶蝉属物种、大白叶蝉(Cofana spectra)、隐瘤蚜属物种、叶蝉属物种、褐软蚧、玉米黄翅叶蝉、裸粉虱属物种、柑橘木虱、麦双尾蚜、西圆尾蚜属物种、小绿叶蝉属物种、苹果绵蚜、葡萄斑叶蝉属物种、加斯卡迪亚(Gascardia)属物种、赤桉木虱(Glycaspis brimblecombei)、菜缢管蚜(Hyadaphis pseudobrassicae)、大尾蚜属物种(Hyalopterus spp.)、超瘤蚜种(Hyperomyzus pallidus)、檬果绿叶蝉(Idioscopus clypealis)、非洲叶蝉、灰飞虱属物种、水土坚蚧、蚧盾蚧属物种、萝卜蚜(Lopaphis erysimi)、莱格尼斯迈迪斯(Lyogenys maidis)、长管蚜属物种、沫蝉属物种、蛾蜡蝉科(Metcalfa pruinosa)、麦无网蚜、麦蜡蝉、瘤蚜属物种、新声蚜属物种(Neotoxoptera sp)、黑尾叶蝉属物种、褐飞虱属物种(Nilaparvata spp.)、梨大绿蚜、奥多纳斯吉拉斯(Odonaspis ruthae)、甘蔗棉蚜、杨梅缘粉虱、考氏木虱、片盾蚧属物种、瘿绵蚜属物种、玉米蜡蝉、扁角飞虱属物种、忽布疣蚜、根

瘤蚜属物种(Phylloxera spp)、动性球菌属物种、桑白盾蚧属物种、粉蚧属物种、棉跳盲蝽(Pseudatomoscelis seriatus)、木虱属物种、棉蚧(Pulvinaria aethiopica)、齿盾蚧属物种、奎萨达吉斯(Quesada gigas)、电光叶蝉(Recilia dorsalis)、缢管蚜属物种、黑盔蚧属物种、带叶蝉属物种、二叉蚜属物种、麦蚜属物种(Sitobion spp.)、白背飞虱、三角苜蓿跳虫(Spissistilus festinus)、条斑飞虱(Tarophagus Proserpina)、声蚜属物种、粉虱属物种、三迪克司博宝力(Tridiscus sporoboli)、葵粉蚧属物种(Trionymus spp.)、非洲木虱、矢尖蚧、火焰斑叶蝉、塞格达斯科瑞(Zyginidia scutellaris);

[0634] 来自膜翅目,例如,

[0635] 顶切叶蚁属(Acromyrmex)、三节叶蜂属物种(Arge spp.)、切叶蚁属物种(Atta spp.)、茎叶蜂属物种(Cephus spp.)、松叶蜂属物种(Diprion spp.)、锯角叶蜂科(Diprionidae)、松叶蜂(Gilpinia polytoma)、实叶蜂属物种(Hoplocampa spp.)、毛蚁属物种(Lasius spp.)、小黄家蚁(Monomorium pharaonis)、新松叶蜂属物种(Neodiprion spp.)、农蚁属物种(Pogonomyrmex spp)、红火蚁、水蚁属物种(Solenopsis spp.)以及胡蜂属物种(Vespa spp.);

[0636] 来自等翅目,例如,

[0637] 家白蚁属物种(Coptotermes spp)、白蚁(Corniternes cumulans)、楹白蚁属物种(Incisitermes spp)、大白蚁属物种(Macrotermes spp)、澳白蚁属物种(Mastotermes spp)、小白蚁属物种(Microtermes spp)、散白蚁属物种(Reticulitermes spp.);热带火蚁(Solenopsis geminate)

[0638] 来自鳞翅目(Lepidoptera),例如,

[0639] 长翅卷蛾属物种、褐带卷蛾属物种、透翅蛾属物种、地夜蛾属物种、棉叶虫、Amylois属物种、黎豆夜蛾、黄卷蛾属物种、银蛾属物种(Argyresthia spp.)、带卷蛾属物种、丫纹夜蛾属物种、棉潜蛾、玉米楷夜蛾、粉斑螟蛾、桃蛀果蛾、禾草螟属物种、色卷蛾属物种、越蔓桔草螟(Chrysoteuchia topiaria)、葡萄果蠹蛾、卷叶螟属物种、云卷蛾属物种、纹卷蛾属物种、鞘蛾属物种、篱笆豆粉蝶(Colias lesbia)、小造桥夜蛾(Cosmophila flava)、草螟属物种、大菜螟、苹果异形小卷蛾、黄杨木蛾、小卷蛾属物种、黄杨绢野螟、杆草螟属物种、苏丹棉铃虫、钻夜蛾属物种、甘薯杆螟、粉斑螟属物种、叶小卷蛾属物种(Epinotia spp.)、盐泽灯蛾(Estigmene acrea)、Etiella zinckinella、花小卷蛾属物种、环针单纹卷蛾、黄毒蛾属物种、切根虫属物种、Feltia jaculiferia、小食心虫属物种(Grapholita spp.)、云雾广翅小卷蛾、实夜蛾属物种、菜螟、切叶野螟属物种(Herpetogramma spp.)、美国白蛾、番茄蠹蛾、Lasmopalpus lignosellus、旋纹潜叶蛾、潜叶细蛾属物种、葡萄花翅小卷蛾、Loxostege bifidalis、毒蛾属物种、潜蛾属物种、幕枯叶蛾属物种(Malacosoma spp.)、甘蓝夜蛾、烟草天蛾、光腹夜蛾属物种(Mythimna spp.)、夜蛾属物种、秋尺蛾属物种、Orniodes indica、欧洲玉米螟、超小卷蛾属物种、褐卷蛾属物种、小眼夜蛾、蛀茎夜蛾、红铃麦蛾、咖啡潜叶蛾、一星黏虫、马铃薯麦蛾、菜粉蝶、粉蝶属物种、小菜蛾、小白巢蛾属物种、尺叶蛾属物种、薄荷灰夜蛾(Rachiplusia nu)、西方豆地香(Richia albicosta)、白禾螟属物种(Scirpophaga spp.)、蛀茎夜蛾属物种、长须卷蛾属物种、灰翅夜蛾属物种、棉大卷叶螟、兴透翅蛾属物种、异舟蛾属物种、卷蛾属物种、粉纹夜蛾、番茄斑潜蝇、以及巢蛾属物种;

[0640] 来自食毛目(Mallophaga),例如,

[0641] 畜虱属物种(Damalinea spp.)和啮毛虱属物种(Trichodectes spp.);

[0642] 来自直翅目(Orthoptera),例如,

[0643] 蠊属物种(Blatta spp.)、小蠊属物种(Blattella spp.)、蝼蛄属物种(Gryllotalpa spp.)、马德拉蜚蠊(Leucophaea maderae)、飞蝗属物种(Locusta spp.)、北痣蟋蟀(Neocurtilla hexadactyla)、大蠊属物种(Periplaneta spp.)、痣蟋蟀属物种(Scapteriscus spp.)、以及沙漠蝗属物种(Schistocerca spp.);

[0644] 来自啮虫目(Psocoptera),例如,

[0645] 虱啮属物种(Liposcelis spp.);

[0646] 来自蚤目(Siphonaptera),例如,

[0647] 角叶蚤属物种(Ceratophyllus spp.)、栉头蚤属物种(Ctenocephalides spp.)以及开皇客蚤(Xenopsylla cheopis);

[0648] 来自缨翅目(Thysanoptera),例如,

[0649] Calliothrips phaseoli、花蓟马属物种(Frankliniella spp.)、阳蓟马属物种(Heliothrips spp)、褐带蓟马属物种(Hercinothrips spp.)、单亲蓟马属物种(Parthenothrips spp.)、非洲桔硬蓟马(Scirtothrips aurantii)、大豆蓟马(Sericothrips variabilis)、带蓟马属物种(Taeniothrips spp.)、蓟马属物种(Thrips spp);

[0650] 来自缨尾目(Thysanura),例如,衣鱼(Lepisma saccharina)。

[0651] 根据本发明的活性成分可以用于控制、即遏制或破坏上述类型的有害生物,这些有害生物特别出现在植物上,尤其是在农业中、在园艺中以及在林业中的有用的植物和观赏植物上,或者在此类植物的器官如果实、花、叶、茎、块茎或根上,并且在一些情况下,甚至在一个随后的时间点形成的植物器官仍保持受保护以抵抗这些有害生物。

[0652] 特别地,适合的目标作物是,谷物,如小麦、大麦、黑麦、燕麦、水稻、玉蜀黍或高粱;甜菜,如糖用甜菜或饲料甜菜;水果,例如梨果、核果或无核小果,如苹果、梨、李子、桃、杏、樱桃或浆果,例如草莓、覆盆子或黑莓;豆科作物,如菜豆、小扁豆、豌豆或大豆;油料作物,如油菜、芥菜、罂粟、橄榄、向日葵、椰子、蓖麻、可可豆或落花生;瓜类作物,如南瓜、黄瓜或甜瓜;纤维植物,如棉花、亚麻、大麻或黄麻;柑橘类水果,如橙子、柠檬、葡萄柚或橘子;蔬菜,如菠菜、莴苣、芦笋、卷心菜、胡萝卜、洋葱、番茄、马铃薯或灯笼椒;樟科,如鳄梨、肉桂或樟脑;以及还有烟草、坚果、咖啡、茄子、甘蔗、茶、胡椒、葡萄藤、蛇麻草、车前草科以及乳胶植物。

[0653] 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。

[0654] 例如,本发明可以用于任何以下观赏植物物种:藿香蓟属物种、假面花属物种(Alonsoa spp.)、银莲花属物种、南非葵(Anisodontea capsenisis)、春黄菊属物种、金鱼草属物种、紫菀属物种、秋海棠属物种(例如丽格海棠、四季秋海棠、球根秋海棠(B.tubéreux))、叶子花属物种、雁河菊属物种(Brachycome spp.)、芸苔属物种(观赏植物)、蒲包草属物种、辣椒、长春花、美人蕉属物种、矢车菊属物种、菊属物种、瓜叶菊属物种(银叶菊(C.maritime))、金鸡菊属物种、红景天(Crassula coccinea)、火红萼距花(Cuphea

ignea)、大丽花属物种、翠雀属物种、荷包牡丹、彩虹菊属物种(Dorotheantus spp.)、洋桔梗、连翘属物种、倒挂金钟属物种、老鹳草属鼠麴草属(Geranium gnaphalium)、大丁草属物种、千日红、天芥菜属物种、向日葵属物种、木槿属物种、绣球花属物种、绣球属物种、嫣红蔓、凤仙花属物种(非洲凤仙花)、血苋属物种(Iresines spp.)、伽蓝菜属物种、马缨丹、三月花葵、狮耳花、百合属物种、松叶菊属物种、沟酸浆属物种、美国薄荷属物种、龙面花属物种、万寿菊属物种、石竹属物种(康乃馨)、美人蕉属物种、酢浆草属物种、雏菊属物种、天竺葵属物种(盾叶天竺葵、马蹄纹天竺葵)、堇菜属物种(三色堇)、碧冬茄属物种、草夹竹桃属物种、香茶菜属物种(Plecthranthus spp.)、一品红属物种、爬山虎属物种(五叶爬山虎、爬山虎)、报春花属物种、毛茛属物种、杜鹃花属物种、蔷薇属物种(玫瑰)、黄雏菊属物种、非洲堇属物种、鼠尾草属物种、紫扇花(Scaevola aemola)、蛾蝶花(Schizanthus wisetonensis)、景天属物种、茄属物种、苏非尼亚矮牵牛属物种(Surfinia spp.)、万寿菊属物种、烟草属物种、马鞭草属物种、百日草属物种以及其他花坛植物。

[0655] 例如,本发明可以用于任何以下蔬菜物种:葱属(大蒜、洋葱、火葱(A.oschaninii)、韭葱、小葱、大葱)、有喙欧芹、旱芹、芦笋、甜菜、芸苔属(甘蓝、大白菜、芜菁)、辣椒、鹰嘴豆、苦苣、菊苣属(菊苣、苦苣)、西瓜、黄瓜属(黄瓜、甜瓜)、南瓜属(西葫芦、印度南瓜)、菜蓟属(朝鲜蓟、刺苞菜蓟)、胡萝卜、茴香、金丝桃属、莴苣、番茄属(番茄、樱桃番茄)、薄荷属、罗勒、香芹、菜豆属(菜豆、荷包豆)、豌豆、萝卜、食用大黄、迷迭香属、鼠尾草属、黑婆罗门参、茄子、菠菜、新缬草属(莴苣缬草、V.eriocarpa)以及蚕豆。

[0656] 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)。

[0657] 根据本发明的活性成分尤其适合于控制棉花、蔬菜、玉米、水稻以及大豆作物上的扁豆蚜、黄瓜条叶甲、烟芽夜蛾、桃蚜、小菜蛾以及海灰翅夜蛾。根据本发明的这些活性成分另外尤其适合于控制甘蓝夜蛾(优选地在蔬菜上)、苹果蠹蛾(优选地在苹果上)、小绿叶蝉(优选地在蔬菜、葡萄园里)、马铃薯叶甲(Leptinotarsa)(优选地在马铃薯上)以及二化螟(优选地在水稻上)。

[0658] 根据本发明的活性成分尤其适合于控制棉花、蔬菜、玉米、水稻以及大豆作物上的扁豆蚜、黄瓜条叶甲、烟芽夜蛾、桃蚜、小菜蛾以及海灰翅夜蛾。根据本发明的这些活性成分另外尤其适合于控制甘蓝夜蛾(优选地在蔬菜上)、苹果蠹蛾(优选地在苹果上)、小绿叶蝉(优选地在蔬菜、葡萄园里)、马铃薯叶甲(Leptinotarsa)(优选地在马铃薯上)以及二化螟(优选地在水稻上)。

[0659] 在另外方面,本发明还可以涉及一种控制由植物寄生线虫(内寄生的-、半内寄生的-和外寄生线虫)对植物及其部分的损害的方法,尤其是以下植物寄生线虫,如根结线虫(root knot nematodes)、北方根结线虫(Meloidogyne hapla)、南方根结线虫(Meloidogyne incognita)、爪哇根结线虫(Meloidogyne javanica)、花生根结线虫(Meloidogyne arenaria)以及其他根结线虫物种;孢囊形成线虫(cyst-forming nematodes)、马铃薯金线虫(Globodera rostochiensis)以及其他球孢囊线虫属

(Globodera)物种;禾谷孢囊线虫(Heterodera avenae)、大豆孢囊线虫(Heterodera glycines)、甜菜孢囊线虫(Heterodera schachtii)、红三叶异皮线虫(Heterodera trifolii)、以及其他异皮线虫属(Heterodera)物种;种瘿线虫(Seed gall nematodes)、粒线虫属(Anguina)物种;茎及叶面线虫(Stem and foliar nematodes)、滑刃线虫属(Aphelenchoides)物种;刺毛线虫(Sting nematodes)、长尾刺线虫(Belonolaimus longicaudatus)以及其他刺线虫属(Belonolaimus)物种;松树线虫(Pine nematodes)、松材线虫(Bursaphelenchus xylophilus)以及其他伞滑刃属(Bursaphelenchus)物种;环形线虫(Ring nematodes)、环线虫属(Criconema)物种、小环线虫属(Criconemella)物种、轮线虫属(Criconemoides)物种、中环线虫属(Mesocriconema)物种;茎及鳞球茎线虫(Stem and bulb nematodes)、腐烂茎线虫(Ditylenchus destructor)、鳞球茎茎线虫(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,如亚粒线虫属物种(Subanguina spp.)、根结线虫属物种(Hypsoperine spp.)、大刺环线虫属物种(Macroposthonia spp.)、矮化线虫属物种(Melinius spp.)、刻点胞囊属物种(Punctodera spp.)、以及五沟线虫属物种(Quinisulcius spp.)。

[0660] 本发明的化合物还可以具有针对软体动物的活性。其实例包括例如福寿螺科;蛞蝓科(Arion)(黑蛞蝓(A.ater)、环状蛞蝓(A.circumscriptus)、棕阿勇蛞蝓(A.hortensis)、红蛞蝓(A.rufus));巴蜗牛科(Bradybaenidae)(灌木巴蜗牛(Bradybaena fruticum));葱蜗牛属(Cepaea)(花园葱蜗牛(C.hortensis)、森林葱蜗牛(C.Nemoralis));ochlodina;野蛞蝓属(Deroceras)(野灰蛞蝓(D.agrestis)、D.empiricorum、光滑野蛞蝓(D.laeve)、网纹野蛞蝓(D.reticulatum));圆盘螺属(Discus)(圆形圆盘蜗牛

(D.rotundatus));Euomphalia;土蜗属(Galba)(截口土蜗(G.trunculata));小蜗牛属(Helicelia)(伊塔拉小蜗牛(H.itala)、布维小蜗牛(H.obvia));大蜗牛科(Helicidae)(Helicigona arbustorum);Helicodiscus;大蜗牛(Helix)(开口大蜗牛(H.aperta));蛞蝓属(Limax)(利迈科斯蛞蝓(L.cinereoniger)、黄蛞蝓(L.flavus)、边缘蛞蝓(L.marginatus)、大蛞蝓(L.maximus)、柔蛞蝓(L.tenellus));椎实螺属(Lymnaea);Milax(小蛞蝓科)(黑色小蛞蝓(M.gagates)、边缘小蛞蝓(M.marginatus)、硕氏小蛞蝓(M.sowerbyi));钻螺属(Opeas);瓶螺属(Pomacea)(福寿螺(P.canaticulata));瓦娄蜗牛属(Vallonia)和Zanitoides。

[0661] 术语“作物”应当理解为还包括已经通过使用重组DNA技术而被这样转化使其能够合成一种或多种选择性作用毒素的作物植物,这些毒素是如已知例如来自于产毒素细菌,特别是芽孢杆菌属的那些细菌。

[0662] 可由这样的转基因植物表达的毒素包括例如杀昆虫蛋白,例如来自蜡样芽孢杆菌或日本金龟子芽孢杆菌的杀昆虫蛋白;或来自苏云金芽孢杆菌的杀昆虫蛋白,如δ-内毒素,例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C,或营养期杀昆虫蛋白(Vip),例如Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A;或细菌定植线虫的杀昆虫蛋白,例如光杆状菌属物种(Photorhabdus spp.)或致病杆菌属物种(Xenorhabdus spp.),诸如发光杆菌(Photorhabdus luminescens)、嗜线虫致病杆菌(Xenorhabdus nematophilus);由动物产生的毒素,如蝎毒素、蛛毒素、蜂毒素和其他昆虫特异性神经毒素;由真菌产生的毒素,如链霉菌毒素,植物凝集素类(lectin),如豌豆凝集素、大麦凝集素或雪花莲凝集素;凝集素(agglutinin);蛋白酶抑制剂,如胰蛋白酶抑制剂、丝氨酸蛋白酶抑制剂、马铃薯糖蛋白、半胱氨酸蛋白酶抑制剂、木瓜蛋白酶抑制剂;核糖体失活蛋白(RIP),如蓖麻毒素、玉米-RIP、相思豆毒素、丝瓜籽毒蛋白、皂草毒素蛋白或异株泻根毒蛋白;类固醇代谢酶,如3-羟基类固醇氧化酶、蜕化类固醇-UDP-糖基-转移酶、胆固醇氧化酶、蜕化素抑制剂、HMG-COA-还原酶、离子通道阻断剂如钠通道或钙通道阻断剂、保幼激素酯酶、利尿激素受体、芪合酶、联苄合酶、几丁质酶和葡聚糖酶。

[0663] 在本发明的背景下,δ-内毒素(例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C)或营养期杀昆虫蛋白(Vip)(例如Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A)应理解为显然还包括混合型毒素、截短的毒素和经修饰的毒素。混合型毒素是通过那些蛋白的不同结构域的新组合重组产生的(参见例如,WO 02/15701)。截短的毒素,例如截短的Cry1Ab是已知的。在经修饰的毒素的情况下,天然存在的毒素的一个或多个氨基酸被替代。在这种氨基酸替代中,优选将非天然存在的蛋白酶识别序列插入毒素中,例如像在Cry3A055的情况下,一种组织蛋白酶-G-识别序列被插入Cry3A毒素中(参见WO 03/018810)。

[0664] 这样的毒素或能够合成这样的毒素的转基因植物的实例披露于例如EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451 878以及WO 03/052073中。

[0665] 用于制备此类转基因植物的方法通常是本领域技术人员已知的并且描述在例如以上提及的公开物中。CryI型脱氧核糖核酸及其制备例如从WO 95/34656、EP-A-0 367 474、EP-A-0 401 979和WO 90/13651中已知。

[0666] 包含在转基因植物中的毒素赋予植物对有害昆虫的耐受性。这样的昆虫可以存在于任何昆虫分类群,但特别常见于甲虫(鞘翅目)、双翅昆虫(双翅目)和蛾(鳞翅目)。

[0667] 包含一种或多种编码杀昆虫抗性并且表达一种或多种毒素的基因的转基因植物是已知的并且其中一些是可商购的。此类植物的实例是:**YieldGard®**(玉蜀黍品种,表达Cry1Ab毒素);YieldGard **Rootworm®**(玉蜀黍品种,表达Cry3Bb1毒素);YieldGard **Plus®**(玉蜀黍品种,表达Cry1Ab和Cry3Bb1毒素);**Starlink®**(玉蜀黍品种,表达Cry9C毒素);Herculex **I®**(玉蜀黍品种,表达Cry1Fa2毒素和获得对除草剂草铵膦铵的耐受性的酶膦丝菌素N-乙酰基转移酶(PAT));NuCOTN **33B®**(棉花品种,表达Cry1Ac毒素);Bollgard **I®**(棉花品种,表达Cry1Ac毒素);Bollgard **II®**(棉花品种,表达Cry1Ac和Cry2Ab毒素);**VipCot®**(棉花品种,表达Vip3A和Cry1Ab毒素);**NewLeaf®**(马铃薯品种,表达Cry3A毒素);**NatureGard®**、**Agrisure®** GT Advantage(GA21耐草甘膦性状)、**Agrisure®** CB Advantage(Bt11玉米螟(CB)性状)以及**Protecta®**。

[0668] 此类转基因作物的另外的实例是:

[0669] 1.Bt11玉蜀黍,来自先正达种子公司(Syngenta Seeds SAS),霍比特路(Chemin de l'Hobit)27,F-31 790圣苏维尔(St.Sauveur),法国,登记号C/FR/96/05/10。遗传修饰的玉蜀黍,通过转基因表达截短的Cry1Ab毒素,使之能抵抗欧洲玉米螟(玉米螟和粉茎螟)的侵袭。Bt11玉蜀黍还转基因表达PAT酶以获得对除草剂草铵膦的耐受性。

[0670] 2.Bt176玉蜀黍,来自先正达种子公司,霍比特路27,F-31 790圣苏维尔,法国,登记号C/FR/96/05/10。遗传修饰的玉蜀黍,通过转基因表达Cry1Ab毒素,使之能抵抗欧洲玉米螟(玉米螟和粉茎螟)的侵袭。Bt176玉蜀黍还转基因表达PAT酶以获得对除草剂草铵膦的耐受性。

[0671] 3.MIR604玉蜀黍,来自先正达种子公司,霍比特路27,F-31 790圣苏维尔,法国,登记号C/FR/96/05/10。通过转基因表达经修饰的Cry3A毒素使之具有昆虫抗性的玉蜀黍。此毒素是通过插入组织蛋白酶-G-蛋白酶识别序列而经修饰的Cry3A055。此类转基因玉蜀黍植物的制备描述于WO 03/018810中。

[0672] 4.MON 863玉蜀黍,来自孟山都欧洲公司(Monsanto Europe S.A.),270-272特弗伦大道(Avenue de Tervuren),B-1150布鲁塞尔,比利时,登记号C/DE/02/9。MON 863表达Cry3Bb1毒素,并且对某些鞘翅目昆虫有抗性。

[0673] 5.IPC 531棉花,来自孟山都欧洲公司,270-272特弗伦大道,B-1150布鲁塞尔,比利时,登记号C/ES/96/02。

[0674] 6.1507玉蜀黍,来自先锋海外公司(Pioneer Overseas Corporation),特德斯科大道(Avenue Tedesco),7B-1160布鲁塞尔,比利时,登记号C/NL/00/10。遗传修饰的玉蜀黍,表达蛋白质Cry1F以获得对某些鳞翅目昆虫的抗性,并且表达PAT蛋白质以获得对除草剂草铵膦的耐受性。

[0675] 7.NK603×MON 810玉蜀黍,来自孟山都欧洲公司,270-272特弗伦大道,B-1150布鲁塞尔,比利时,登记号C/GB/02/M3/03。通过将遗传修饰的品种NK603和MON 810杂交,由常规育种的杂交玉蜀黍品种构成。NK603×MON 810玉蜀黍转基因地表达由土壤杆菌属菌株CP4获得的蛋白质CP4 EPSPS,赋予其耐除草剂**Roundup®**(含有草甘膦),以及还有由苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种获得的Cry1Ab毒素,赋予其耐某些鳞翅目昆虫,包括欧洲玉

米螟。

[0676] 抗昆虫的植物的转基因作物还描述于BATS(生物安全与可持续发展中心(Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit),BATS中心(Zentrum BATS),克拉斯崔舍(Clarastrasse)13,巴塞尔(Basel)4058,瑞士)报告2003(http://bats.ch)中。

[0677] 术语“作物”应理解为还包括已经通过使用重组DNA技术而被这样转化使其能够合成具有选择性作用的抗病原物质的作物植物,这些抗病原物质是例如像所谓的“病程相关蛋白”(PRP,参见例如EP-A-0 392 225)。这样的抗病原物质和能够合成这样的抗病原物质的转基因植物的实例例如从EP-A-0 392 225、WO 95/33818和EP-A-0 353 191是已知的。生产此类转基因植物的方法对于本领域技术人员而言通常是已知的并且描述于例如以上提及的公开物中。

[0678] 作物也可以经修饰以增强对真菌(例如镰孢霉属、炭疽病或疫霉属)、细菌(例如假单胞菌属)或病毒(例如马铃薯卷叶病毒、番茄斑萎病毒、黄瓜花叶病毒)病原体的抗性。

[0679] 作物还包括对线虫(如大豆异皮线虫)具有增强的抗性的那些作物。

[0680] 具有对非生物性胁迫的耐受性的作物包括例如通过NF-YB或本领域中已知的其他蛋白质的表达对干旱、高盐、高温、寒冷、霜或光辐射具有增强的耐受性的那些作物。

[0681] 可由这样的转基因植物表达的抗病原物质包括例如离子通道阻断剂,如钠通道和钙通道的阻断剂,例如病毒KP1、KP4或KP6毒素;芪合酶;联苄合酶;几丁质酶;葡聚糖酶;所谓“病程相关蛋白”(PRP;参见例如EP-A-0 392 225);由微生物产生的抗病原物质,例如肽抗生素或杂环抗生素(参见例如WO 95/33818)或参与植物病原体防御的蛋白质或多肽因子(所谓“植物疾病抗性基因”,如WO 03/000906中所述)。

[0682] 根据本发明的组合物的另外的使用领域是保护所储存的物品和储存室以及保护原材料,如木材、纺织品、地板或建筑物,以及还在卫生领域中,特别是保护人类、家畜以及多产的牲畜免遭所提及类型的有害生物的侵害。

[0683] 本发明还提供了一种用于控制有害生物(如蚊和其他疾病媒介物;同样参见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、撒布或浸渍,向目标有害生物、向它们的场所或向表面或基底施用本发明的组合物。通过举例,通过本发明的方法考虑到了表面(如墙、天花板或地板表面)的IRS(室内滞留喷雾)施用。在另一个实施例中,考虑到了将此类组合物施用至基底,如无纺或织物材料,该材料以网织品、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)。

[0684] 在一个实施例中,用于控制此类有害生物的方法包括向目标有害生物、向它们的场所或向表面或基底施用杀有害生物有效量的本发明的组合物,以便在该表面或基底上提供有效的滞留的杀有害生物活性。这样的施用可以通过涂刷、轧制、喷雾、撒布或浸渍本发明的杀有害生物组合物来进行。通过举例,通过本发明的方法考虑到了表面(如墙、天花板或地板表面)的IRS施用,以便在该表面上提供有效的滞留的杀有害生物活性。在另一个实施例中,考虑了施用此类组合物以用于对基底上的有害生物的残留控制,该基底是如以网织品、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。

[0685] 要处理的基底(包括无纺物、织物或网织品)可以由天然纤维,如棉花、拉菲亚树叶纤维、黄麻、亚麻、剑麻、粗麻布或羊毛,或合成纤维,如聚酰胺、聚酯、聚丙烯、聚丙烯腈等制

成。聚酯是特别合适的。纺织品处理的方法是已知的,例如WO 2008/151984、WO 2003/034823、US 5631072、WO 2005/64072、WO2006/128870、EP 1724392、WO 2005113886或WO 2007/090739。

[0686] 根据本发明的组合物的另外使用领域是针对所有观赏树木以及所有种类的果树和坚果树的树木注射/树干处理领域。

[0687] 在树木注射/树干处理领域中,根据本发明的化合物尤其适合于对抗来自如上提及的鳞翅目和来自鞘翅目的蛀木昆虫,尤其是对抗下表A和表B中列出的蛀木虫:

[0688] 表A.具有经济重要性的外来蛀木虫的实例。

[0689]

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

[0690] 表B.具有经济重要性的本地蛀木虫的实例。

[0691]

科	种	受侵染的宿主或作物
吉丁虫科	*桦锈窄吉丁（Agrilus anxius）*	桦树

[0692]

科	种	受侵染的宿主或作物
	磨光窄吉丁（Agrilus politus）	柳树、枫树
	赛惠窄吉丁(Agrilus sayi)	杨梅、香蕨木
	维塔蒂科利斯窄吉丁（Agrilus vittaticolllis）	苹果树、梨树、蔓越橘、唐棣、山楂树
	苹扁头吉丁（Chrysobothris femorata）	苹果、杏、山毛榉、白蜡槭、樱桃树、栗树、红醋栗树、榆树、山楂树、朴树、山核桃树、欧洲七叶树、菩提树、枫树、欧洲花楸树、橡树、美洲山核桃树、梨树、桃树、柿子树、李子树、杨树、温柏、美国紫荆、唐棣、美国梧桐、核桃树、柳树
	野油菜得克萨那(Texania campestris)	椴木、山毛榉、枫树、橡树、美国梧桐、柳树、黄杨
天牛科	*对山毛榉天牛（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

[0693]

科	种	受侵染的宿主或作物
		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（Oberea tripunctata）	山茱萸、荚蒾属、榆树、酸模树、蓝莓、杜鹃花属、杜鹃、月桂树、杨树、柳树、桑树
	绕枝沟胫天牛（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
	尼替斯特罗菲纳（Strophiona nitens）	栗树、橡树、山核桃树、核桃树、山毛榉、枫树
小蠹科	哥伦布小蠹（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	桃树、樱桃树、李子树、黑樱

[0694]

科	种	受侵染的宿主或作物
	liminaris）	桃树、榆树、桑树、欧洲花楸树
	鬃额小蠹（*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	*栋透翅蛾*（*Paranthrene simulans*）	橡树、美洲栗树
	柿透翅蛾（*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
	鲁布罗法克斯透翅蛾（*Synanthedon rubrofascia*）	蓝果树
	瑞木透翅蛾（*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、英蓬属、柳树、苹果树、枇杷树、九层皮、杨梅
	葡萄根透翅蛾（*Vitacea polistiformis*）	葡萄树

[0695] 本发明还可以用于控制任何可能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、南方麦小蜡以及蛴螬。本发明可以用于控制处于其生命周期的各个阶段的昆虫有害生物,包括卵、幼虫、若虫和成虫。

[0696] 特别地,本发明可以用于控制用草坪草的根部喂养的昆虫有害生物,这些昆虫有害生物包括蛴螬(如圆头犀金龟属(Cyclocephala spp.)(例如标记的金龟子、C.lurida)、Rhizotrogus属(例如欧洲金龟子,欧洲切根鳃金龟(R.majalis))、黄栌属(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(硕蚧属(Margarodes spp.))、蝼蛄(褐黄色的、南方的、以及短翅的;痣蟋蟀属物种(Scapteriscus spp.)、非洲蝼蛄(Gryllotalpa africana))以及大蚊幼虫(leatherjackets)(欧洲大蚊(European crane fly)、大蚊属物种(Tipula spp.))。

[0697] 本发明还可以用于控制茅草住宅的草坪草的昆虫有害生物,这些昆虫有害生物包括粘虫(如秋夜蛾(fall armyworm)草地贪夜蛾,和常见粘虫一星黏虫(Pseudaletia unipuncta)),切根虫,象鼻虫(尖隐喙象属物种(Sphenophorus spp.),如S.venatus verstitus和牧草长喙象(S.parvulus))以及草地螟(如草螟属物种(Crambus spp.)和热带草地螟,Herpetogramma phaeopteralis)。

[0698] 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(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。

[0699] 本发明还可以用于控制草坪草中的其他有害生物,如在草坪中创建蚁巢的外引红火蚁(红火蚁(Solenopsis invicta))。

[0700] 在卫生领域中,根据本发明的组合物有效地对抗体表寄生虫如硬蜱、软蜱、疥螨、秋螨、蝇(叮咬和舔舐)、寄生性蝇幼虫,虱、发虱、鸟虱和跳蚤。

[0701] 此类寄生虫的实例是:

[0702] 虱目:血虱属物种、长颚虱属物种(Linognathus spp.)、人虱属物种以及阴虱属物种(Phtirus spp.)、管虱属物种。

[0703] 食毛目:毛羽虱属物种、短羽虱属物种、鸭虱属物种、牛羽虱属物种、韦尼克拉(Werneckiella spp.)、莱皮肯特伦属物种(Lepikentron spp.)、畜虱属物种、啮毛虱属物种以及猫羽虱属物种(Felicola spp.)。

[0704] 双翅目及长角亚目(Nematocerina)和短角亚目(Brachycerina),例如伊蚊属物种(Aedes spp.)、疟蚊属物种、库蚊属物种(Culex spp.)、蚋属物种(Simulium spp.)、真蚋属物种(Eusimulium spp.)、白蛉属物种(Phlebotomus spp.)、罗蛉属物种(Lutzomyia spp.)、库蠓属物种(Culicoides spp.)、斑虻属物种(Chrysops spp.)、驼背虻属物种(Hybomitra spp.)、黄虻属物种(Atylotus spp.)、虻属物种(Tabanus spp.)、麻虻属物种(Haematopota spp.)、菲洛比米亚属物种(Philipomyia spp.)、蜂虱蝇属物种(Braula spp.)、家蝇属物种(Musca spp.)、齿股蝇属物种(Hydrotaea spp.)、螯蝇属物种、黑角蝇属物种(Haematobia spp.)、莫蝇属物种(Morellia spp.)、厕蝇属物种(Fannia spp.)、舌蝇属物种(Glossina spp.)、丽蝇属物种(Calliphora spp.)、绿蝇属物种(Lucilia spp.)、金蝇属物种(Chrysomyia spp.)、污蝇属物种(Wohlfahrtia spp.)、麻蝇属物种(Sarcophaga spp.)、狂蝇属物种(Oestrus spp.)、皮蝇属物种(Hypoderma spp.)、胃蝇属物种(Gasterophilus spp.)、虱蝇属物种(Hippobosca spp.)、羊虱蝇属物种(Lipoptena spp.)和蜱蝇属物种(Melophagus spp.)。

[0705] 蚤目(Siphonapterida),例如蚤属物种(Pulex spp.)、栉头蚤属物种、客蚤属物种(Xenopsylla spp.)、角叶蚤属物种。

[0706] 异翅目(Heteropterida),例如臭虫属物种、锥鼻虫属物种、红猎蝽属物种、锥蝽属物种(Panstrongylus spp.)。

[0707] 蜚蠊目(Blattarida),例如东方蜚蠊(Blatta orientalis)、美洲大蠊(Periplaneta americana)、德国小蠊(Blattelagermanica)以及夏柏拉蠋螂属物种(Supella spp.)。

[0708] 蜱螨(Acaria)亚纲(螨科(Acarida))和后气门目(Meta-stigmata)和中气门目(Meso-stigmata),例如锐缘蜱属物种(Argas spp.)、钝缘蜱属物种(Ornithodorus spp.)、耳蜱属物种(Otobius spp.)、硬蜱属物种(Ixodes spp.)、钝眼蜱属物种(Amblyomma spp.)、牛蜱属物种(Boophilus spp.)、革蜱属物种(Dermacentor spp.)、血蜱属物种(Haemophysalis spp.)、璃眼蜱属物种(Hyalomma spp.)、扇头蜱属物种(Rhipicephalus spp.)、皮刺螨属物种(Dermanyssus spp.)、刺利螨属物种(Raillietia spp.)、肺刺螨属物种(Pneumonyssus spp.)、胸刺螨属物种(Sternostoma spp.)和瓦螨属物种(Varroa spp.)。

[0709] 轴螨目(Actinedida)(前气门亚目(Prostigmata))和粉螨目(Acaridida)(无气门亚目(Astigmata)),例如蜂盾螨属物种(Acarapis spp.)、姬螯螨属物种(Cheyletiella spp.)、禽螯螨属物种(Ornithocheyletia spp.)、肉螨属物种(Myobia spp.)、疮螨属物种(Psorergates spp.)、蠕形螨属物种(Demodex spp.)、恙螨属物种(Trombicula spp.)、牦螨属物种(Listrophorus spp.)、粉螨属物种(Acarus spp.)、食酪螨属物种(Tyrophagus spp.)、嗜木螨属物种(Caloglyphus spp.)、颈下螨属物种(Hypodectes spp.)、翅螨属物种(Pterolichus spp.)、痒螨属物种(Psoroptes spp.)、皮螨属物种(Chorioptes spp.)、耳痒螨属物种(Otodectes spp.)、疥螨属物种(Sarcoptes spp.)、耳螨属物种(Notoedres spp.)、鸟疥螨属物种(Knemidocoptes spp.)、胞螨属物种(Cytodites spp.)以及鸡雏螨属物种(Laminosioptes spp.)。

[0710] 根据本发明的组合物还适用于保护在如木材、纺织品、塑料、粘合剂、胶、漆料、纸张和卡片、皮革、地板和建筑等的材料情况下免受昆虫侵染。

[0711] 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(Hylotrupes bajulus)、长毛天牛(Chlorophorus pilosis)、家具窃蠹(Anobium punctatum)、红毛窃蠹(Xestobium rufovillosum)、梳角细脉窃蠹(Ptilinuspecticornis)、Dendrobium pertinex、松芽枝窃蠹(Ernobius mollis)、Priobium carpini、褐粉蠹(Lyctus brunneus)、非洲粉蠹(Lyctus africanus)、南方粉蠹(Lyctus planicollis)、栎粉蠹(Lyctus linearis)、柔毛粉蠹(Lyctus pubescens)、胸粉蠹(Trogoxylon aequale)、鳞毛粉蠹(Minthesrugicollis)、材小蠹属物种(Xyleborus spec.)、条木小蠹属物种(Tryptodendron spec.)、咖啡黑长蠹(Apate monachus)、槲长蠹(Bostrychus capucins)、棕异翅长蠹(Heterobostrychus brunneus)、双棘长蠹属物种(Sinoxylon spec.)以及竹长蠹(Dinoderus minutus),以及还有膜翅类,如蓝黑树蜂(Sirex juvencus)、大树蜂(Urocerus gigas)、泰加大树蜂(Urocerus gigas taignus)和Urocerus augu,以及白蚁类,如欧洲木白蚁(Kalotermes flavicollis)、麻头堆砂白蚁(Cryptotermes brevis)、印巴结构木异白蚁(Heterotermes indicola)、黄胸散白蚁(Reticulitermes flavipes)、桑特散白蚁(Reticulitermes santonensis)、欧洲散白蚁

(Reticulitermes lucifugus)、达尔文澳白蚁(Mastotermes darwiniensis)、内华达古白蚁(Zootermopsis nevadensis)与家白蚁(Coptotermes formosanus),以及蛀虫,如衣鱼(Lepisma saccharina)。

[0712] 根据本发明的化合物能够以未经修饰的形式用作杀有害生物剂,但它们通常以多种方式使用配制辅助剂(如载体、溶剂和表面活性物质)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:粉尘剂、凝胶、可湿性粉剂、水可分散性颗粒剂、水可分散性片剂、泡腾压缩片剂、可乳化的浓缩物、可微乳化的浓缩物、水包油乳剂、可流动油、水性分散体、油性分散体、悬乳剂、胶囊悬浮液、可乳化的颗粒剂、可溶性液体、水可溶性浓缩物(以水或水混溶性有机溶剂作为载体)、浸渍的聚合物膜或处于已知的其他形式,例如从Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides[关于杀有害生物剂的FAO和WHO标准的发展和使用的手册],联合国,第1版,二次修订(2010)中已知的。此类配制品可以直接使用或可以在使用前稀释再使用。可以用例如水、液体肥料、微量营养素、生物有机体、油或溶剂来进行稀释。

[0713] 可以通过例如将活性成分与配制辅助剂混合来制备这些配制品以便获得以精细分散固体、颗粒、溶液、分散体或乳剂形式的组合物。这些活性成分还可以与其他辅助剂(如精细分散的固体、矿物油、植物或动物来源的油、改性的植物或动物来源的油、有机溶剂、水、表面活性物质或其组合)来一起配制。

[0714] 这些活性成分还可以被包含于非常精细的微胶囊中。微胶囊在多孔载体中含有活性成分。这使得活性成分能够以受控的量释放(例如,缓慢释放)到环境中。微胶囊通常具有0.1至500微米的直径。它们包含的活性成分的量按重量计是胶囊重量的约25%至95%。这些活性成分可以处于整体性固体的形式、处于固体或液体分散体中的精细颗粒的形式或处于适合溶液的形式。包囊的膜可以包含例如天然的或合成的橡胶、纤维素、苯乙烯/丁二烯共聚物、聚丙烯腈、聚丙烯酸酯、聚酯、聚酰胺、聚脲、聚氨酯或化学改性的聚合物以及淀粉黄原酸酯、或本领域的技术人员已知的其他聚合物。可替代地,可以形成非常精细的微胶囊,其中活性成分是以精细分散颗粒的形式被包含在基础物质的固体基质中,但这些微胶囊本身未经包裹。

[0715] 适合于制备根据本发明的组合物的配制辅助剂本身是已知的。作为液体载体可以使用:水、甲苯、二甲苯、石油醚、植物油、丙酮、甲基乙基酮、环己酮、酸酐、乙腈、乙酰苯、乙酸戊酯、2-丁酮、碳酸亚丁酯、氯苯、环己烷、环己醇、乙酸烷基酯、二丙酮醇、1,2-二氯丙烷、二乙醇胺、对-二乙基苯、二甘醇、松香酸二乙二醇酯、二甘醇丁基醚、二甘醇乙基醚、二甘醇甲醚、N,N-二甲基甲酰胺、二甲基亚砜、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、碳酸亚乙酯、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,例如戊醇、四氢呋喃醇、己醇、辛醇、乙二醇、丙二醇、甘油、N-甲基-2-吡咯烷酮等。

[0716] 合适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、经研磨的胡桃壳、木质素和类似的物质。

[0717] 许多表面活性物质可以有利地用在固体和液体配制品两者中,尤其是在使用前可被载体稀释的那些配制品中。表面活性物质可以是阴离子的、阳离子的、非离子的或聚合的并且它们可以用作乳化剂、湿润剂或悬浮剂或用于其他目的。典型的表面活性物质包括例如烷基硫酸酯的盐,如十二烷基硫酸二乙醇铵;烷基芳基磺酸酯的盐,如十二烷基苯磺酸钙;烷基酚/氧化烯加成产物,如乙氧基化壬基苯酚;醇/氧化烯加成产物,如乙氧基化十三烷醇;皂,如硬脂酸钠;烷基萘磺酸酯的盐,如二丁基萘磺酸钠;磺基琥珀酸二烷基酯的盐,如二(2-乙基己基)磺基琥珀酸钠;山梨糖醇酯,如山梨糖醇油酸酯;季胺,如氯化十二烷基三甲基铵;脂肪酸的聚乙二醇酯,如聚乙二醇硬脂酸酯;环氧乙烷和环氧丙烷的嵌段共聚物;以及磷酸单烷基酯和二烷基酯的盐;以及还有另外物质,例如描述于:McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual[麦卡琴清洁剂和乳化剂年鉴],MC出版公司(MC Publishing Corp.),里奇伍德,新泽西州(Ridgewood New Jersey)(1981)。

[0718] 可以用于杀有害生物配制品的另外辅助剂包括结晶抑制剂、粘度调节剂、悬浮剂、染料、抗氧化剂、发泡剂、光吸收剂、混合助剂、消泡剂、络合剂、中和或改变pH的物质和缓冲液、腐蚀抑制剂、香料、湿润剂、吸收增强剂、微量营养素、增塑剂、助流剂、润滑剂、分散剂、增稠剂、防冻剂、杀微生物剂、以及液体和固体肥料。

[0719] 根据本发明的组合物可以包括添加剂,该添加剂包括植物或动物来源的油、矿物油、这样的油的烷基酯或这样的油与油衍生物的混合物。在根据本发明的组合物中的油添加剂的量通常是基于该待施用的混合物的从0.01%到10%。例如,可以在喷雾混合物已经制备之后将该油添加剂以所期望的浓度添加到喷雾罐中。优选的油添加剂包括矿物油或植物来源的油,例如菜籽油、橄榄油或葵花籽油;乳化的植物油;植物来源的油的烷基酯,例如甲基衍生物;或动物来源的油,如鱼油或牛脂。优选的油添加剂包括C_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、棕榈酸和油酸的甲基酯(分别是月桂酸甲酯、棕榈酸甲酯和油酸甲酯)。许多油衍生物从Compendium of Herbicide Adjuvants[除草剂辅助剂纲要],第10版,南伊利诺伊大学,2010中已知。

[0720] 本发明组合物通常包含按重量计从0.1%至99%、尤其是按重量计从0.1%至95%的本发明化合物以及按重量计从1%至99.9%的配制辅助剂,该配制辅助剂优选地包括按重量计从0至25%的表面活性物质。而商用产品可以优选地被配制为浓缩物,最终使用者将通常采用稀配制品。

[0721] 施用比率在宽范围内变化并且取决于土壤的性质,施用方法,作物植物,要控制的有害生物,主要气候条件,以及受施用方法、施用时间以及目标作物支配的其他因素。一般来讲,可以将化合物以从1l/ha至2000l/ha、尤其是从10l/ha到1000l/ha的比率施用。

[0722] 优选的配制品可以具有以下组成(重量%):

[0723] 可乳化的浓缩物:

[0724] 活性成分:1%至95%,优选60%至90%

[0725] 表面活性剂：1％至30％,优选5％至20％

[0726] 液体载体：1％至80％,优选1％至35％

[0727] 尘粉剂：

[0728] 活性成分：0.1％至10％,优选0.1％至5％

[0729] 固体载体：99.9％至90％,优选99.9％至99％

[0730] 悬浮液浓缩物：

[0731] 活性成分：5％至75％,优选10％至50％

[0732] 水：94％至24％,优选88％至30％

[0733] 表面活性剂：1％至40％,优选2％至30％

[0734] 可湿性粉剂：

[0735] 活性成分：0.5％至90％,优选1％至80％

[0736] 表面活性剂：0.5％至20％,优选1％至15％

[0737] 固体载体：5％至95％,优选15％至90％

[0738] 颗粒剂：

[0739] 活性成分：0.1％至30％,优选0.1％至15％

[0740] 固体载体：99.5％至70％,优选97％至85％

[0741] 以下实例进一步说明了(但不限制)本发明。

[0742]

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％	-

[0743] 将该组合与这些佐剂充分混合并且将混合物在适合的研磨机中充分研磨,从而获得了可以用水稀释而给出所希望的浓度的悬浮液的可湿性粉剂。

[0744]

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％

[0745] 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获得可以直接用于种子处理的粉剂。

[0746]

可乳化的浓缩物	
活性成分	10％
辛基酚聚乙二醇醚(4-5 mol的环氧乙烷)	3％

十二烷基苯磺酸钙	3%
蓖麻油聚乙二醇醚(35 mol的环氧乙烷)	4%
环已酮	30%
二甲苯混合物	50%

[0747] 在植物保护中可以使用的具有任何所要求的稀释的乳液可以通过用水稀释由这种浓缩物获得。

[0748]

尘粉剂	a)	b)	c)
活性成分	5%	6%	4%
滑石	95%	-	-
高岭土	-	94%	-
矿物填料	-	-	96%

[0749] 通过将该组合与载体混合并且将混合物在适合的研磨机中研磨而获得即用型尘粉剂。此类粉剂还可以用于种子的干拌种。

[0750]

挤出机颗粒剂	
活性成分	15%
木质素磺酸钠	2%
羧甲基纤维素	1%
高岭土	82%

[0751] 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。

[0752]

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

[0753] 将该精细研磨的组合在混合器中均匀地施用于用聚乙二醇湿润的高岭土中。以此方式获得无尘的包衣的颗粒剂。

[0754] 悬浮液浓缩物

[0755]

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

[0756] 将该精细研磨的组合与佐剂紧密地混合,得到悬浮液浓缩物,从该悬浮液浓缩物可以通过用水稀释获得任何所希望的稀释度的悬浮液。使用此类稀释物,可以通过喷雾、浇灌或浸渍对活的植物以及植物繁殖材料进行处理和保护以免受微生物侵染。

[0757] 种子处理用的可流动浓缩物

[0758]

活性成分	40%
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(以在水中的20%溶液的形式)	0.5%
单偶氮-颜料钙盐	5%
硅油(以在水中的75%乳液的形式)	0.2%
水	45.3%

[0759] 将该精细研磨的组合与佐剂紧密地混合,得到悬浮液浓缩物,从该悬浮液浓缩物可以通过用水稀释获得任何所希望的稀释度的悬浮液。使用此类稀释物,可以通过喷雾、浇灌或浸渍对活的植物以及植物繁殖材料进行处理和保护以免受微生物侵染。

[0760] 缓释的胶囊悬浮液

[0761] 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。将这种混合物在1.2份的聚乙烯醇、0.05份的消泡剂以及51.6份的水的混合物中乳化直至达到所希望的粒度。向这种乳液中添加在5.3份的水中的2.8份的1,6-已二胺混合物。将混合物搅拌直至聚合反应完成。将获得的胶囊悬浮液通过添加0.25份的增稠剂以及3份的分散剂进行稳定。该胶囊悬浮液配制品含有28%的活性成分。介质胶囊的直径是8-15微米。将所得配制品在适合于此目的装置中作为水性悬浮液施用到种子上。

[0762] 配制品类型包括乳液浓缩物(EC)、悬浮液浓缩物(SC)、悬乳液(SE)、胶囊悬浮液(CS)、水可分散性颗粒剂(WG)、可乳化的颗粒剂(EG)、乳剂、油包水型乳液(EO)、水包油型乳液(EW)、微乳液(ME)、油分散体(OD)、油悬剂(oil miscible flowable)(OF)、油溶性液剂(OL)、可溶性浓缩物(SL)、超低容量悬浮液(SU)、超低容量液剂(UL)、母药(TK)、可分散性浓缩物(DC)、可湿性粉剂(WP)、可溶性颗粒剂(SG)或与农业上可接受的辅助剂组合的任何技术上可行的配制品。

[0763] 制备实例:

[0764] “Mp”意指以℃计的熔点。自由基表示甲基基团。在Brucker400MHz光谱仪上记录^{1}H NMR测量值,相对于TMS标准以ppm给出化学位移。光谱在如指定的氘代溶剂中测量。用以下LCMS方法中的任一种来表征这些化合物。对于每种化合物获得的特征LCMS值是保留时间(“Rt”,以分钟记录)和测得的分子离子$(M+H)^+$或$(M-H)^-$。

[0765] LCMS和GCMS方法:

[0766] 方法1:

[0767] 在来自沃特斯公司(Waters Corporation)的质谱仪(SQD、SQDII或QDA单四极杆质谱仪)上记录光谱,其装备有电喷射源(极性:正离子和负离子),毛细管电压:0.8-3.00kV,锥孔:5-30V,源温度:120℃-150℃,去溶剂化温度:350℃-600℃,锥孔气体流量:50-150l/h,去溶剂化气体流量:650-1000l/h,质量范围:110至950Da和来自沃特斯公司的Acquity UPLC:二元泵、经加热的柱室、二极管阵列检测器和ELSD。柱:Waters UPLC HSS T3,1.8μm,30x 2.1mm,温度:60℃,DAD波长范围(nm):210至400,运行时间:1.5min;溶剂:A=水+5% MeOH+0.05% HCOOH,B=乙腈+0.05%HCOOH;流量(ml/min)0.85,梯度:10% B等度持续

0.2min,然后在1.0min内10％-100％ B,100％ B等度持续0.2min,在0.05min内100％-10％ B,10％ B等度持续0.05min。

[0768] 方法2:

[0769] 在来自沃特斯公司(Waters Corporation)的质谱仪(SQD、SQDII或QDA单四极杆质谱仪)上记录光谱,其装备有电喷射源(极性:正离子和负离子),毛细管电压:0.8-3.00kV,锥孔:5-30V,源温度:120℃-150℃,去溶剂化温度:350℃-600℃,锥孔气体流量:50-150l/h,去溶剂化气体流量:650-1000l/h,质量范围:110至950Da和来自沃特斯公司的Acquity UPLC:二元泵、经加热的柱室、二极管阵列检测器和ELSD。柱:Waters UPLC HSS T3,1.8μm,30x 2.1mm,温度:60℃,DAD波长范围(nm):210至400,运行时间:3.0min;溶剂:A＝水+5％ MeOH+0.05％ HCOOH,B＝乙腈+0.05％HCOOH;流量(ml/min)0.85,梯度:10％ B等度持续0.2min,然后在2.5min内10％-100％ B,100％ B等度持续0.3min。

[0770] 方法3:

[0771] 在来自沃特斯公司(Waters)的质谱仪(SQD2或QDA单四级杆质谱仪)上记录光谱,该质谱仪装备有电喷射源(极性:正和负极性转换),毛细管:0.8-3.00kV,锥孔范围:25源温度:120℃-150℃,去溶剂化温度:500℃-600℃,锥孔气体流量:50L/h,去溶剂化气体流量:1000L/h,质量范围:110至850Da)和来自沃特斯公司的Acquity UPLC:四元溶剂管理器,经加热的柱室,二极管阵列检测器。柱:Acquity UPLC HSS T3 C18,1.8μm,30x 2.1mm,温度:40℃,DAD波长范围(nm):200至400,溶剂梯度:A＝水+5％乙腈+0.1％HCOOH,B＝乙腈+0.05％ HCOOH:梯度:0min 10％ B;0.min-0.2min 10％-50％ B;0.2min-0.6min 50％-100％ B;0.6min-1.3min100％ B;1.3min-1.4min 100％-10％ B;1.4min-1.6min 10％ B;流量(mL/min)0.6。

[0772] 方法4:

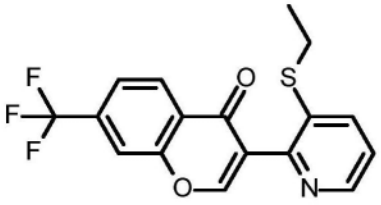
[0773] 在来自安捷伦科技公司的质谱仪(MSD-IQ质谱仪)上记录光谱,其装备有电喷射源(极性:正离子或负离子,MS2扫描,毛细管电压:3.5kV,碎裂电压:110V,去溶剂化温度:325℃,气体流量:13L/min,喷雾器气体:55psi,质量范围:110至850Da)和来自安捷伦公司(Agilent)的1290系列HPLC:四元泵,经加热的柱室以及二极管阵列检测器。柱:AGILENT POROSHELL 120EC-C18,1.9μm,50x 2.1mm,温度:40℃,DAD波长范围(nm):190至400,溶剂梯度:A＝水+5％乙腈+0.1％ HCOOH,B＝乙腈+0.1％ HCOOH:梯度:0-0.5min 10％ B,90％ A;1.2-1.5min 95％ B,05％ A;1.8-2.5min 10％ B,90％ A;流量(mL/min)0.8。

[0774] 方法5:

[0775] 在来自沃特斯公司的ACQUITY质谱仪(SQD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:3.0kV,锥孔:30V,提取器:3.00V,源温度:150℃,去溶剂化温度:400℃,锥孔气体流量:60L/hr,去溶剂化气体流量:700L/hr,质量范围:140至800Da)和来自沃特斯公司的ACQUITY UPLC,其具有溶剂脱气装置、二元泵、经加热的柱室以及二极管阵列检测器。柱:Waters UPLC HSS T3,1.8μm,30x 2.1mm,温度:60℃,DAD波长范围(nm):210至400,溶剂梯度:A＝水/甲醇9:1+0.1％甲酸,B＝乙腈+0.1％甲酸,梯度:0％-100％ B,在2.5min内;流量(ml/min)0.75。

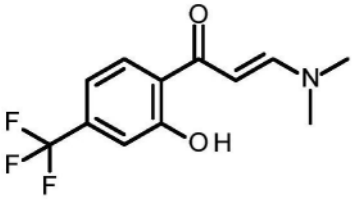
[0776] 实例P1:3-(3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-7-(三氟甲基)色烯-4-酮的制备

[0777] (化合物P1)

[0778] 

(P1)

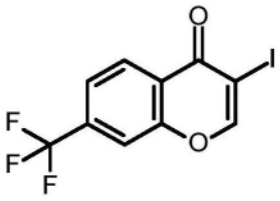
[0779] 步骤1:(E)-3-(二甲基氨基)-1-[2-羟基-4-(三氟甲基)苯基]丙-2-烯-1-酮(中间体I1)的制备

[0780] 

(I1)

[0781] 将1-(2-羟基-4-三氟甲基)苯基)乙烯酮(4.77g,22.2mmol)和N,N-二甲基-甲酰胺二甲基乙缩醛(3.84mL,28.9mmol,1.3当量)的混合物在100℃下搅拌2小时。冷却至室温之后,将反应混合物用水稀释,并且将水相用乙酸乙酯萃取两次。将合并的有机相用水洗涤,然后用盐水洗涤,经硫酸镁干燥,过滤,并且真空浓缩。粗材料不经任何纯化直接使用。LCMS(方法1):Rt=0.98min,m/z 260[M+H]$^+$。

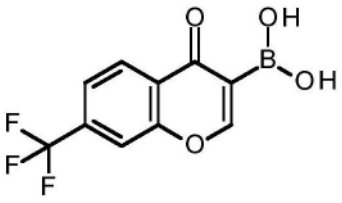
[0782] 步骤2:3-碘-7-(三氟甲基)色烯-4-酮(中间体I2)的制备

[0783] 

(I2)

[0784] 向在5℃下冷却的(E)-3-(二甲基氨基)-1-[2-羟基-4-(三氟甲基)苯基]丙-2-烯-1-酮(5.96g,23mmol)在甲醇(57mL)中的溶液中添加碘(7.00g,27.6mmol,1.2当量)。将反应混合物在室温下搅拌17小时。将混合物用硫代硫酸钠水溶液稀释并且搅拌15分钟。将所形成的沉淀物过滤,然后溶解在乙酸乙酯中。将有机相用盐水洗涤两次,经硫酸镁干燥,并且用isolute真空浓缩。将粗材料通过硅胶快速色谱法(在环己烷中的乙酸乙酯)纯化以得到呈橙色固体的期望产物。LCMS(方法1):Rt=1.02min,m/z 341[M+H]$^+$。

[0785] 步骤3:[4-氧代-7-(三氟甲基)色烯-3-基]硼酸(中间体I3)的制备

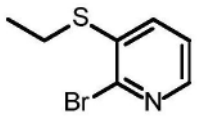
[0786] 

(I3)

[0787] 向在-78℃下冷却的3-碘-7-(三氟甲基)色烯-4-酮(0.3g,0.88mmol)在THF(1.5mL)中的溶液中逐滴添加异丙基氯化镁氯化锂络合物(1.3M,在THF中)(0.95mL,1.23mmol,1.4当量)。将反应混合物在-78℃下搅拌15分钟,然后添加硼酸三甲酯(0.25mL,2.21mmol,2.5当量)。然后允许反应混合物温热至室温并且搅拌2小时。将混合物用氯化铵

水溶液稀释,将产物用乙酸乙酯萃取两次,将合并的有机相经硫酸镁干燥,并且真空浓缩。粗材料不经任何纯化直接使用。LCMS(方法1):Rt＝0.89min,m/z 259[M+H]$^+$。

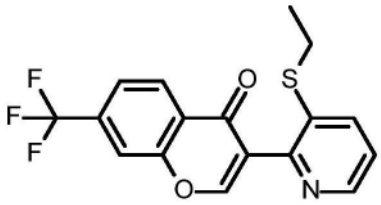
[0788] 步骤4:2-溴-3-乙基硫烷基-吡啶(中间体I4)的制备

[0789] 

(I4)

[0790] 向在-50℃下冷却的2-溴-3-氟-吡啶(CAS:40273-45-8)(24.9g,141mmol)在N,N-二甲基-甲酰胺(80mL)中的溶液中添加乙硫醇钠(13.2g,141mmol,1当量)。将反应混合物冷却至-60℃并且在该温度下搅拌20min,并且然后允许温热至室温。将反应混合物用水和乙酸乙酯稀释。将水相用乙酸乙酯萃取(3次)。将合并的有机相用水洗涤两次,然后用盐水洗涤,经硫酸镁干燥,并且用isolute真空浓缩。将粗材料通过硅胶快速色谱法(在环己烷中的乙酸乙酯)纯化以得到呈无色油状物的期望产物。LCMS(方法1):Rt＝0.94min,m/z 218/220[M+H]$^+$。

[0791] 步骤5:3-(3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-7-(三氟甲基)色烯-4-酮(化合物P1)的制备

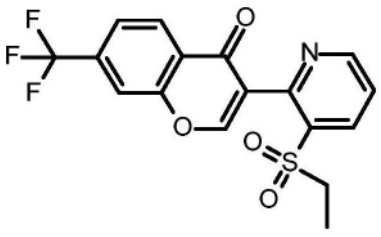
[0792] 

(P1)

[0793] 向用氩气脱气的2-溴-3-乙基硫烷基-吡啶(0.025g,0.116mmol)和[4-氧代-7-(三氟-甲基)色烯-3-基]硼酸(0.03g,0.116mmol,1当量)在二噁烷(0.46mL)中的溶液中添加1,1′-双(二苯基膦基)二茂铁]二氯化钯(II)与二氯甲烷的络合物(0.010g,0.0116mmol,0.1当量)、水(0.17mL)和碳酸钾(0.048g,0.348mmol,3当量)。将反应混合物在氩气下在60℃下搅拌70分钟。允许混合物冷却至室温,用碳酸氢钠水溶液稀释,并且将产物用乙酸乙酯萃取。将有机相用盐水洗涤,经硫酸镁干燥,过滤并且真空浓缩。将粗材料通过硅胶快速色谱法(在环己烷中的乙酸乙酯)纯化以得到期望产物。LCMS(方法1):Rt＝1.03min,m/z 352[M+H]$^+$。

[0794] 实例P2:3-(3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-7-(三氟甲基)色烯-4-酮的制备

[0795] (化合物P2)

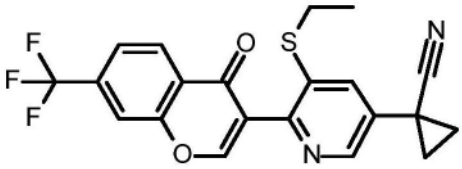
[0796] 

(P2)

[0797] 向在0℃下的3-(3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-7-(三氟甲基)色烯-4-酮(0.048g,0.137mmol)在乙酸乙酯(0.72mL)中的溶液中添加3-氯过氧苯甲酸(0.064g,0.288mmol,2.1当量),并且将混合物在室温下搅拌2小时。将反应混合物用亚硫酸氢钠水溶液淬灭并且将产物用乙酸乙酯萃取。将有机相用水洗涤,然后用碳酸氢钠水溶液洗涤,经硫酸镁干燥,过

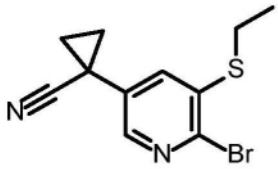
滤并且真空浓缩。将粗材料通过制备型HPLC(在水中的乙腈与甲酸)纯化以得到呈固体的期望产物。LCMS(方法1):Rt＝0.91min,m/z 384[M+H]$^+$。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δppm1.34(t,3H),3.40(q,2H),7.62(dd,1H),7.71(dd,1H),7.85(s,1H),8.16(s,1H),8.42(m,2H),8.94(dd,1H)。

[0798] 实例P3:1-[5-乙基硫烷基-6-[4-氧代-7-(三氟甲基)色烯-3-基]-3-吡啶基]环丙烷-甲腈(化合物P3)的制备

[0799] 

(P3)

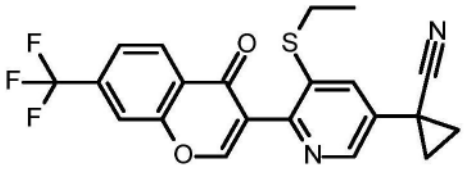
[0800] 步骤1:1-(6-溴-5-乙基硫烷基-3-吡啶基)环丙烷甲腈(中间体I5)的制备

[0801] 

(I5)

[0802] 向1-(6-氨基-5-乙基硫烷基-3-吡啶基)环丙烷甲腈(如WO 2020/174094中所描述的制备)(6.95g,31.7mmol)在二溴乙烷(69.5mL)中的溶液中添加溴化铜(II)(10.7g,47.5mmol,1.5当量)。将反应混合物在室温下搅拌10分钟,然后逐滴添加亚硝酸异戊酯(6.52mL,47.5mmol,1.5当量)。将混合物在室温下进一步搅拌4.5小时。将反应混合物用碳酸氢钠水溶液和乙酸乙酯稀释,然后经硅藻土过滤。将水相用乙酸乙酯萃取两次。将合并的有机相用水和用碳酸氢钠水溶液洗涤,经硫酸镁干燥,并且用isolute真空浓缩。将粗材料通过硅胶快速色谱法(在环己烷中的乙酸乙酯)纯化以得到呈黄色固体的期望产物。LCMS(方法1):Rt＝0.99min,m/z 283/285[M+H]$^+$。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δppm 1.44(t,3H),1.47(m,2H),1.83(m,2H),3.01(q,2H),7.45(d,1H),7.94(d,1H)。

[0803] 步骤2:1-[5-乙基硫烷基-6-[4-氧代-7-(三氟甲基)色烯-3-基]-3-吡啶基]环丙烷-甲腈(化合物P3)的制备

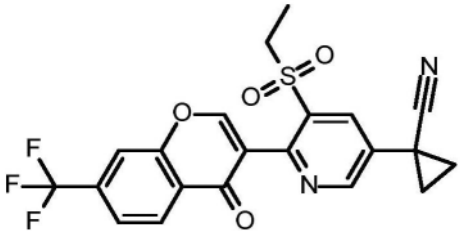
[0804] 

(P3)

[0805] 向用氩气脱气的1-(6-溴-5-乙基硫烷基-3-吡啶基)环丙烷甲腈(0.030g,0.106mmol)和[4-氧代-7-(三氟甲基)色烯-3-基]硼酸(0.027g,0.106mmol,1当量)在乙腈(0.82mL)中的溶液中添加1,1′-双(二苯基膦基)二茂铁]二氯化钯(II)与二氯甲烷的络合物(0.009g,0.011mmol,0.1当量)、水(0.32mL)和碳酸钾(0.037g,0.265mmol,2.5当量)。将反应混合物在氩气下在60℃下搅拌45分钟。允许混合物冷却至室温,用碳酸氢钠水溶液稀释,并且将产物用乙酸乙酯萃取。将有机相用盐水洗涤,经硫酸镁干燥,过滤并且真空浓缩。将粗材料通过硅胶快速色谱法(在环己烷中的乙酸乙酯)纯化以得到呈固体的期望产物。LCMS(方法1):Rt＝1.07min,m/z 417[M+H]$^+$。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δppm 1.29(t,3H),1.54

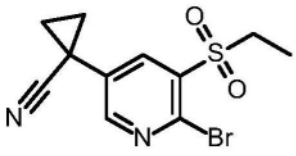
(m,2H),1.87(m,2H),2.95(q,2H),7.69(d,1H),7.72(d,1H),7.83(s,1H),8.13(s,1H),8.34(d,1H),8.44(d,1H)。

[0806] 实例P4:1-[5-乙基磺酰基-6-[4-氧代-7-(三氟甲基)色烯-3-基]-3-吡啶基]环丙烷-甲腈(化合物P4)的制备

[0807] 

(P4)

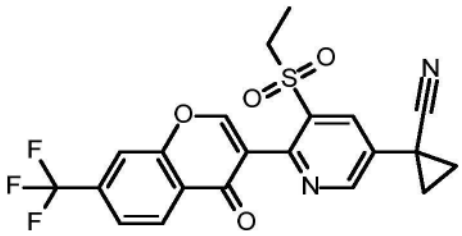
[0808] 步骤1:1-(6-溴-5-乙基磺酰基-3-吡啶基)环丙烷甲腈(中间体I6)的制备

[0809] 

(I6)

[0810] 在0℃下,向1-(6-溴-5-乙基硫烷基-3-吡啶基)环丙烷甲腈(4.19g,14.8mmol)在乙酸乙酯(59mL)中的溶液中分批添加3-氯过氧苯甲酸(7.83g,34mmol,2.3当量),并且将混合物在室温下搅拌16小时。将反应混合物通过逐滴添加亚硫酸氢钠水溶液淬灭,搅拌10分钟,然后用碳酸氢钠水溶液稀释,并且将产物用乙酸乙酯萃取。将有机相用氢氧化钠水溶液洗涤,然后用碳酸氢钠水溶液洗涤,经硫酸镁干燥,过滤并且真空浓缩。粗材料不经任何纯化直接使用。LCMS(方法1):Rt=0.77min,m/z 315/317$[M+H]^+$。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δppm1.34(t,3H),1.55(m,2H),1.94(m,2H),3.56(q,2H),8.17(d,1H),8.67(d,1H)。

[0811] 步骤2:1-[5-乙基磺酰基-6-[4-氧代-7-(三氟甲基)色烯-3-基]-3-吡啶基]环丙烷-甲腈(化合物P4)的制备

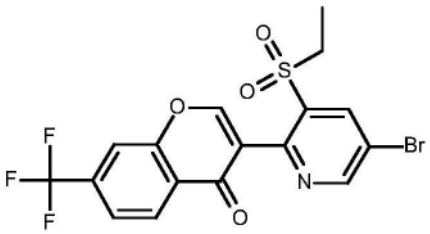
[0812] 

(P4)

[0813] 在0℃下,向用氩气脱气的1-(6-溴-5-乙基磺酰基-3-吡啶基)环丙烷甲腈(0.696g,2.7mmol)和[4-氧代-7-(三氟甲基)色烯-3-基]硼酸(0.858g,2.7mmol,1当量)在乙腈(14mL)中的溶液中添加1,1′-双(二苯基膦基)二茂铁]二氯化钯(II)与二氯甲烷的络合物(0.231g,0.27mmol,0.1当量)、水(5.4mL)和碳酸钾(0.858g,6.21mmol,2.3当量)。将混合物在60℃下搅拌20分钟。允许反应混合物冷却至室温,用水稀释,并且将产物用乙酸乙酯萃取两次。将合并的有机相用氢氧化钠水溶液和盐水洗涤,经硫酸镁干燥,过滤并且用isolute真空浓缩。将粗材料通过硅胶快速色谱法(在环己烷中的乙酸乙酯)纯化以得到呈固体的期望产物。LCMS(方法1):Rt=0.98min,m/z 449$[M+H]^+$。

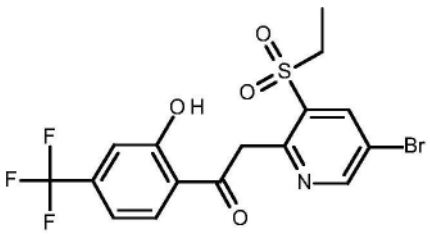
[0814] 实例P5:3-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-7-(三氟甲基)-色烯-4-酮(化合物

P9)的制备

[0815] 

(P9)

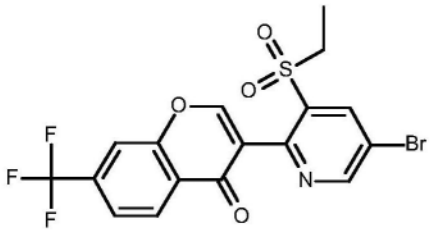
[0816] 步骤1:2-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-[2-羟基-4-(三氟甲基)苯基]乙烯酮(中间体I7)

[0817] 

(I7)

[0818] 向2-羟基-4-(三氟甲基)苯基-乙酮(3.00g,14.70mmol)和2,5-二溴-3-乙基磺酰基-吡啶(4.835g,14.70mmol)在DMSO(21mL)中的溶液中添加碳酸钾(2.641g,19.104mmol,1.30当量)。将混合物在室温下搅拌1天。然后添加另外的碳酸钾(2.0g),并且将混合物在室温下再搅拌一天。然后添加水,并且将混合物用乙酸乙酯萃取两次。将合并的有机相用水和盐水洗涤,用硫酸镁干燥,过滤,并且浓缩。将残余物通过色谱法(环己烷-乙酸乙酯-1%AcOH)纯化以得到3.18g的2-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-[2-羟基-4-(三氟甲基)苯基]-乙烯酮。LCMS(方法1):Rt=1.10min,m/z 452/454$[M+H]^+$。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δppm 1.34(t,3H),3.24(q,2H),5.12(s,2H),7.24(d,1H),7.31(s,1H),8.02(d,1H),8.48(d,1H),8.87(d,1H),11.78(s,1H)。

[0819] 步骤2:3-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-7-(三氟甲基)-色烯-4-酮(化合物P9)

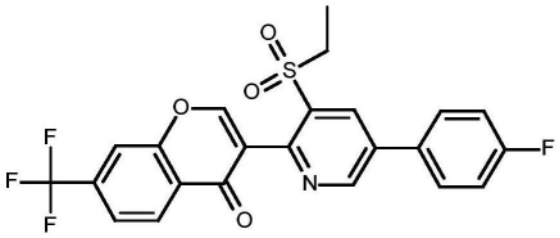
[0820] 

(P9)

[0821] 将2-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-1-[2-羟基-4-(三氟甲基)苯基]-乙烯酮(2.48g,5.48mmol)和N,N-二甲基甲酰胺-二甲基乙缩醛(0.949mL,7.13mmol,1.30当量)在甲醇(19.8mL)中的混合物在回流下搅拌2.5小时。然后添加水,并且将混合物用乙酸乙酯萃取两次。将合并的有机相用水和盐水洗涤,用硫酸镁干燥,过滤,并且浓缩。色谱法(环己烷-乙酸乙酯)得到期望产物和起始材料的混合物。将混合物溶解在甲醇(20mL)中并且添加N,N-二甲基甲酰胺-二甲基乙缩醛(0.5m)。将混合物在回流下搅拌16小时。LC/MS示出完全转化并且不再有起始材料的迹线。添加水并且将混合物用乙酸乙酯萃取两次。将合并的有机相用水和盐水洗涤,用硫酸镁干燥,过滤并且浓缩以得到1.66g的3-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-7-(三氟甲基)-色烯-4-酮。LCMS(方法1):Rt=1.04min,m/z 462/464$[M+H]^+$。^1H

NMR(400MHz,$CDCl_3$)δppm 1.38(t,3H),3.43(q,2H),7.72(d,1H),7.88(s,1H),8.18(s,1H),8.41(d,1H),8.54(d,1H),8.98(d,1H)。

[0822] 实例P6:3-[3-乙基磺酰基-5-(4-氟苯基)-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮(化合物P16)的制备

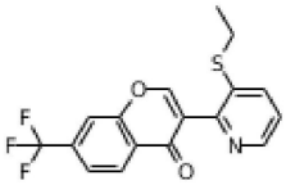
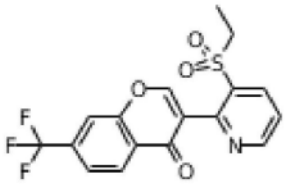
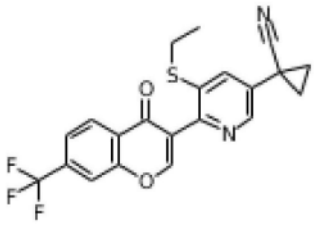
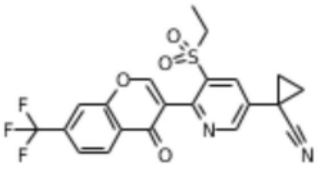
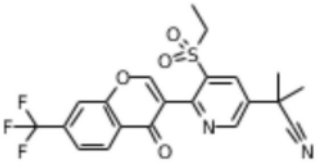
[0823] 

(P16)

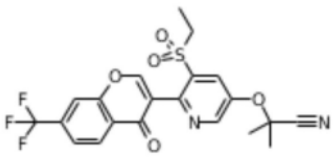
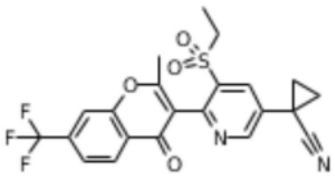
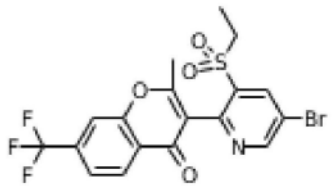
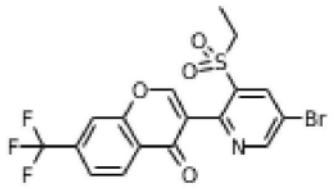
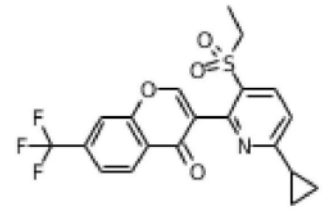
[0824] 向3-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-7-(三氟甲基)色烯-4-酮(105mg,0.227mmol)在甲苯(20mL)和水(4mL)中的溶液中添加碳酸钠(61mg,0.568mmol,2.5当量)和(4-氟苯基)硼酸(111mg,0.7951mmol,3.5当量)。将反应混合物在室温下在氮气气氛下搅拌,然后添加四-(三苯基膦)-钯(0)(27mg,0.0227mmol,0.1当量),将反应混合物在90℃下搅拌12小时。在反应完成之后,将物质冷却至室温并且添加水(20mL)。将混合物用乙酸乙酯萃取(三次)。将合并的有机层用盐水洗涤,经硫酸钠干燥并真空浓缩。将残余物通过快速色谱法(使用在环己烷中的30%乙酸乙酯)纯化以得到65mg的3-[3-乙基磺酰基-5-(4-氟苯基)-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮。LCMS(方法3):Rt=1.07min,m/z 478$[M+H]^+$。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δppm 1.37(t,3H),3.43(d,2H),7.15-7.28(m,2H),7.60-7.69(m,2H),7.73(d,1H),7.87(s,1H),8.21(s,1H),8.42(d,1H),8.54(d,1H),9.10(宽的s,1H)。

[0825] 表P:具有式(I)的化合物的实例

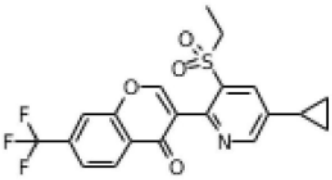
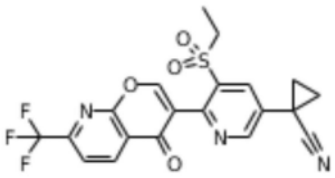
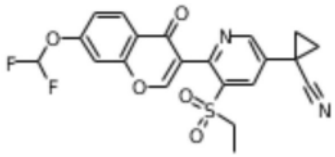
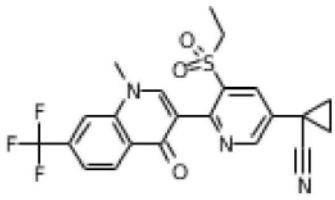
[0826]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R_t (min)	$[M+H]^+$ (测量的)	方法	
P1	3-(3-乙基硫烷基-2-吡啶基)-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.03	352	1	-
P2	3-(3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		0.91	384	1	-
P3	1-[5-乙基硫烷基-6-[4-氧代-7-(三氟甲基)色烯-3-基]-3-吡啶基]环丙烷-甲腈		1.07	417	1	-
P4	1-[5-乙基磺酰基-6-[4-氧代-7-(三氟甲基)色烯-3-基]-3-吡啶基]环丙烷-甲腈		0.98	449	1	182-185
P5	2-[5-乙基磺酰基-6-[4-氧代-7-(三氟甲基)色烯-3-基]-3-吡啶基]-2-甲基-丙烷-甲腈		0.98	451	1	

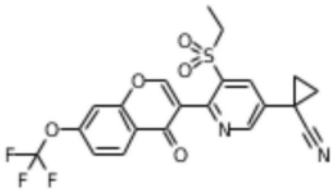
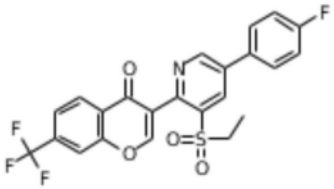
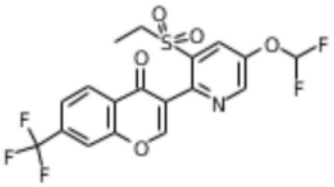
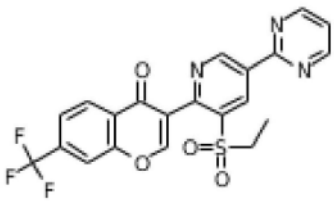
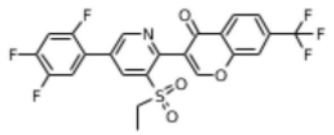
[0827]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R_t (min)	$[M+H]^+$ (测量的)	方法	
P6	2-[[5-乙基磺酰基-6-[4-氧代-7-(三氟甲基)色烯-3-基]-3-吡啶基]氧基]-2-甲基-丙腈		1.65	467	4	144-146
P7	1-[5-乙基磺酰基-6-[2-甲基-4-氧代-7-(三氟甲基)色烯-3-基]-3-吡啶基]环丙烷-甲腈		0.97	463	1	
P8	3-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-2-甲基-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.06	476/478	1	
P9	3-(5-溴-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-7-(三氟甲基)-色烯-4-酮		1.04	462/464	1	
P10	3-(6-环丙基-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.07	424	1	

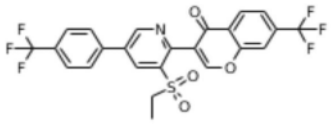
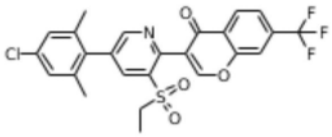
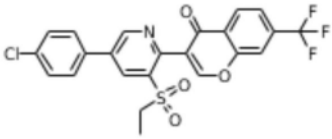
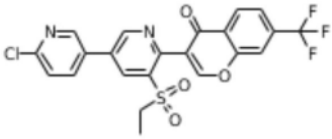
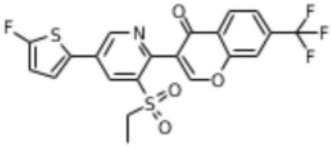
[0828]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R_t (min)	$[M+H]^+$ (测量的)	方法	
P11	3-(5-环丙基-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		0.98	424	1	
P12	1-[5-乙基磺酰基-6-[4-氧代-7-(三氟甲基)吡喃并[2,3-b]吡啶-3-基]-3-吡啶基]-环丙烷甲腈		0.85	450	1	179-181
P13	1-[6-[7-(二氟甲氧基)-4-氧代-色烯-3-基]-5-乙基磺酰基-3-吡啶基]-环丙烷甲腈		0.87	447	1	
P14	1-[5-乙基磺酰基-6-[1-甲基-4-氧代-7-(三氟甲基)-3-喹啉基]-3-吡啶基]-环丙烷甲腈		1.04	462	3	208-209

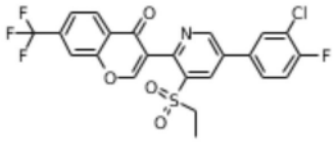
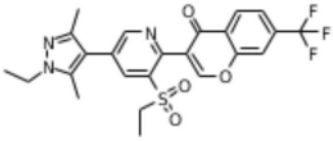
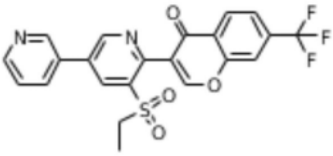
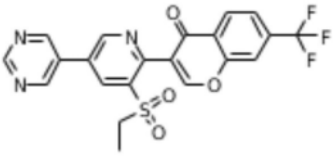
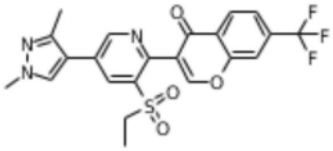
[0829]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R_t (min)	$[M+H]^+$ (测量的)	方法	
P15	1-[5-乙基磺酰基-6-[4-氧代-7-(三氟甲氧基)色烯-3-基]-3-吡啶基]-环丙烷-甲腈		0.98	465	1	
P16	3-[3-乙基磺酰基-5-(4-氟苯基)-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.07	478	3	158-160
P17	3-[5-(二氟甲氧基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.64	450	4	
P18	3-(3-乙基磺酰基-5-嘧啶-2-基-2-吡啶基)-7-(三氟-甲基)色烯-4-酮		1.51	462	4	232 - 234
P19	3-[3-乙基磺酰基-5-(2,4,5-三氟苯基)-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.76	514.41	5	

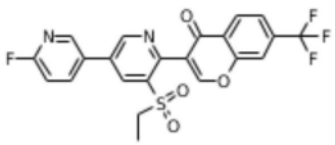
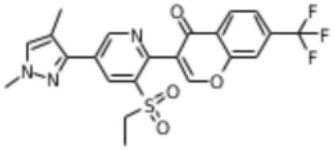
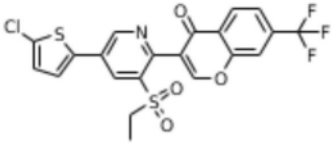
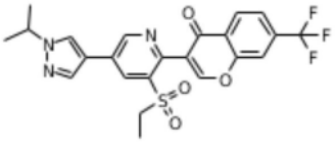
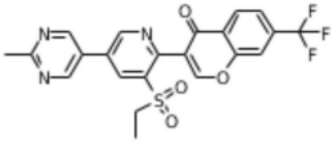
[0830]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R_t (min)	$[M+H]^+$ (测量的)	方法	
P20	3-[3-乙基磺酰基-5-[4-(三氟甲基)苯基]-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)-色烯-4-酮		1.84	528.43	5	
P21	3-[5-(4-氯-2,6-二甲基-苯基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)-色烯-4-酮		1.95	522.43	5	
P22	3-[5-(4-氯苯基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.8	494.38	5	
P23	3-[5-(6-氯-3-吡啶基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.57	495.38	5	
P24	3-[3-乙基磺酰基-5-(5-氟-2-噻吩基)-2-吡啶基]-7-(三氟-甲基)色烯-4-酮		1.74	484.36	5	

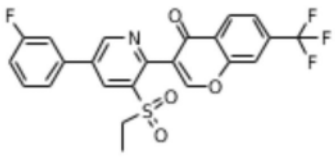
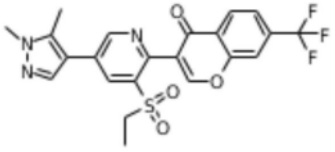
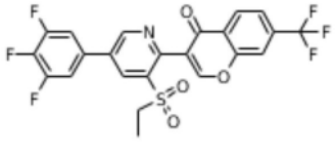
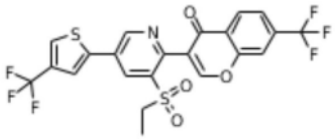
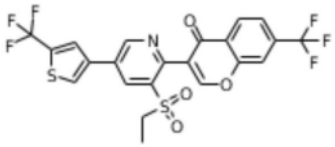
[0831]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R_t (min)	$[M+H]^+$ (测量的)	方法	
P25	3-[5-(3-氯-4-氟-苯基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.81	512.4	5	
P26	3-[5-(1-乙基-3,5-二甲基-吡唑-4-基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)-色烯-4-酮		1.52	506.51	5	
P27	3-[3-乙基磺酰基-5-(3-吡啶基)-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)-色烯-4-酮		1.29	461.42	5	
P28	3-(3-乙基磺酰基-5-嘧啶-5-基-2-吡啶基)-7-(三氟-甲基)色烯-4-酮		1.55	462.29	5	
P29	3-[5-(1,3-二甲基吡唑-4-基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.4	478.45	5	

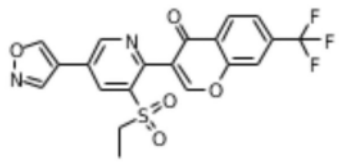
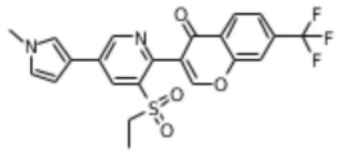
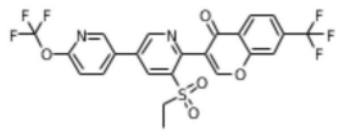
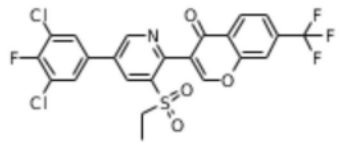
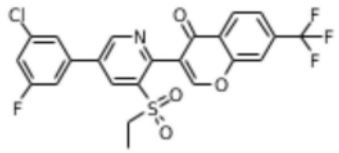
[0832]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R_t (min)	$[M+H]^+$ (测量的)	方法	
P30	3-[3-乙基磺酰基-5-(6-氟-3-吡啶基)-2-吡啶基]-7-(三氟-甲基)色烯-4-酮		1.5	479.4	5	
P31	3-[5-(1,4-二甲基吡唑-3-基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.51	478.46	5	
P32	3-[5-(5-氯-2-噻吩基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.84	500.35	5	
P33	3-[3-乙基磺酰基-5-(1-异丙基吡唑-4-基)-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)-色烯-4-酮		1.53	492.46	5	
P34	3-[3-乙基磺酰基-5-(2-甲基嘧啶-5-基)-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)-色烯-4-酮		1.33	476.43	5	

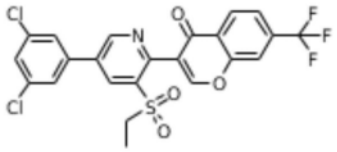
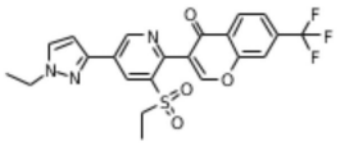
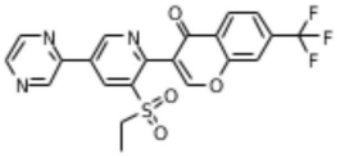
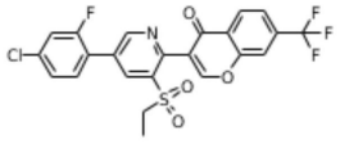
[0833]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R_t (min)	$[M+H]^+$ (测量的)	方法	
P35	3-[3-乙基磺酰基-5-(3-氟苯基)-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.71	478.43	5	
P36	3-[5-(1,5-二甲基吡唑-4-基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.4	478.44	5	
P37	3-[3-乙基磺酰基-5-(3,4,5-三氟苯基)-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.78	514.41	5	
P38	3-[3-乙基磺酰基-5-[4-(三氟甲基)-2-噻吩基]-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)-色烯-4-酮		1.82	534.4	5	
P39	3-[3-乙基磺酰基-5-[5-(三氟甲基)-3-噻吩基]-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)-色烯-4-酮		1.83	534.4	5	

[0834]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R_t (min)	$[M+H]^+$ (测量的)	方法	
P40	3-(3-乙基磺酰基-5-异噁唑-4-基-2-吡啶基)-7-(三氟甲基)-色烯-4-酮		1.39	451.38	5	
P41	3-[3-乙基磺酰基-5-(1-甲基吡咯-3-基)-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.55	463.44	5	
P42	3-[3-乙基磺酰基-5-[6-(三氟甲氧基)-3-吡啶基]-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)-色烯-4-酮		1.75	545.44	5	
P43	3-[5-(3,5-二氯-4-氟-苯基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)-色烯-4-酮		1.94	546.38	5	
P44	3-[5-(3-氯-5-氟-苯基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.84	512.4	5	

[0835]

编号	IUPAC 名称	结构	LCMS			Mp (°C)
			R_t (min)	$[M+H]^+$ (测量的)	方法	
P45	3-[5-(3,5-二氯苯基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.94	528.37	5	
P46	3-[5-(1-乙基吡唑-3-基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.53	478.46	5	
P47	3-(3-乙基磺酰基-5-吡嗪-2-基-2-吡啶基)-7-(三氟-甲基)色烯-4-酮		1.55	462.28	5	
P48	3-[5-(4-氯-2-氟-苯基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-7-(三氟甲基)色烯-4-酮		1.84	512.39	5	

[0836] 通过添加其他杀昆虫、杀螨和/或杀真菌活性的成分,根据本发明的组合物的活性可以显著地加宽,并且适合于普遍情况。具有式I的化合物与其他杀昆虫、杀螨和/或杀真菌活性的成分的混合物还可以具有另外的出人意料的优点,这些优点还可以在更宽的意义上描述为协同活性。例如,植物的更好的耐受性、降低的植物毒性、昆虫可以在它们的不同发育阶段得到控制、或在它们的生产期间(例如,在研磨或混合期间,在它们的储存期间或它们的使用期间)的更好的行为。

[0837] 在此,适合添加的活性成分是例如以下类别的活性成分的代表:有机磷化合物、硝基苯酚衍生物、硫脲、保幼激素、甲脒、二苯甲酮衍生物、脲、吡咯衍生物、氨基甲酸酯、拟除虫菊酯、氯化烃、酰基脲、吡啶基亚甲基氨基衍生物、大环内酯类、新烟碱以及苏芸金芽孢杆菌制剂。

[0838] 具有式I的化合物与活性成分的以下混合物是优选的(缩写"TX"意指"选自由以下组成的组的一种化合物:描述于本发明的表A-1至A-36、表B-1至B-36、表C-1至C-36和表D-1至D-36以及表P中的化合物"):

[0839] 辅助剂,该辅助剂选自由以下组成的物质组:石油(别名)(628)+TX;

[0840] 阿维菌素+TX、灭螨醌+TX、啶虫脒+TX、乙酰虫腈+TX、氟丙菊酯+TX、氟螨啶(acynonapyr)+TX、双丙环虫酯+TX、阿福拉纳(afoxolaner)+TX、棉铃威+TX、丙烯除虫菊酯+TX、α-氯氰菊酯+TX、甲体氯氰菊酯+TX、磺胺螨酯+TX、灭害威+TX、三唑锡+TX、杀虫磺+TX、苯螨特+TX、苯嘧虫噁烷(benzpyrimoxan)+TX、β-氟氯氰菊酯+TX、β-氯氰菊酯+TX、联苯肼酯+TX、联苯菊酯+TX、乐杀螨+TX、生物烯丙菊酯+TX、S-生物烯丙菊酯+TX、生物苄呋菊酯+TX、双三氟虫脲+TX、溴虫氟苯双酰胺(broflanilide)+TX、溴氟菊酯+TX、溴硫磷-乙基+TX、噻嗪酮+TX、丁酮威+TX、硫线磷+TX、西维因+TX、丁硫克百威+TX、巴丹+TX,CAS号:1632218-00-8+TX、CAS号:1808115-49-2+TX、CAS号:2032403-97-5+TX、CAS号:2044701-44-0+TX、CAS号:2128706-05-6+TX、CAS号:2095470-94-1+TX、CAS号:2377084-09-6+TX、CAS号:1445683-71-5+TX、CAS号:2408220-94-8+TX、CAS号:2408220-91-5+TX、CAS号:1365070-72-9+TX、CAS号:2171099-09-3+TX、CAS号:2396747-83-2+TX、CAS号:2133042-31-4+TX、CAS号:2133042-44-9+TX、CAS号:1445684-82-1+TX、CAS号:1445684-82-1+TX、CAS号:1922957-45-6+TX、CAS号:1922957-46-7+TX、CAS号:1922957-47-8+TX、CAS号:1922957-48-9+TX、CAS号:2415706-16-8+TX、CAS号:1594624-87-9+TX、CAS号:1594637-65-6+TX、CAS号:1594626-19-3+TX、CAS号:1990457-52-7+TX、CAS号:1990457-55-0+TX、CAS号:1990457-57-2+TX、CAS号:1990457-77-6+TX、CAS号:1990457-66-3+TX、CAS号:1990457-85-6+TX、CAS号:2220132-55-6+TX、CAS号:1255091-74-7+TX、CAS号:RNA(马铃薯甲虫-特异性重组双链干扰GS2)+TX、CAS号:2719848-60-7+TX、CAS号:1956329-03-5+TX、氯虫苯甲酰胺+TX、氯丹+TX、溴虫腈+TX、氯炔丙菊酯+TX、环虫酰肼+TX、克仑吡林+TX、除线威(cloethocarb)+TX、噻虫胺+TX、2-氯苯基N-甲基氨基甲酸酯(CPMC)+TX、苯腈磷+TX、溴氰虫酰胺+TX、环溴虫酰胺+TX、环丁氟仑(cyclobutrifluram)+TX、拟除虫菊酯+TX、环氧虫啶+TX、腈吡螨酯+TX、乙唑螨腈(cyetpyrafen或etpyrafen)+TX、丁氟螨酯+TX、氟氯氰菊酯+TX、氯氟氰虫酰胺(cyhalodiamide)+TX、三氟氯氰菊酯+TX、氯氰菊酯+TX、苯氰菊酯+TX、环丙氟虫胺(cyproflanilide)+TX、灭蝇胺+TX、溴氰菊酯+TX、杀螨隆+TX、氯亚胺硫磷+TX、二溴磷(dibrom)+TX、二氯噻吡嘧啶(dicloromezotiaz)+TX、氟螨嗪+TX、除虫脲+TX、嗪虫唑酰胺(dimpropyridaz)+TX、二活菌素+TX、敌螨普+TX、呋虫胺+TX、蔬果磷+TX、埃玛菌素(或埃玛菌素苯甲酸盐)+TX、右旋烯炔菊酯+TX、ε-莫氟菊酯(epsilon-momfluorothrin)+TX、ε-甲氧苄氟菊酯+TX、高氰戊菊酯+TX、乙硫磷+TX、乙虫腈+TX、醚菊酯+TX、乙螨唑+TX、伐灭磷+TX、喹螨醚+TX、五氟苯菊酯+TX、双噻唑(fenmezoditiaz)+TX、杀螟硫磷+TX、仲丁威+TX、苯硫威+TX、苯氧威+TX、甲氰菊酯+TX、唑螨酯(fenpyroximate)+TX、丰索磷+TX、倍硫磷+TX、叶塞灵+TX、氰戊菊酯+TX、氟虫腈+TX、氟虫碳酸酯(flometoquin)+TX、氟啶虫酰胺+TX、嘧螨酯+TX、三氟咪啶酰胺(fluazaindolizine)+TX、啶蜱脲+TX、氟虫双酰胺+TX、氟螨噻+TX、氟氯虫双酰胺(fluchlordiniliprole)+TX、氟西特纳特(flucitrinate)+TX、氟螨脲+TX、氟氰戊菊酯+TX、氟噻虫砜+TX、嘧虫胺+TX、三氟醚菊酯+TX、丁烯氟虫腈+TX、氟己虫腈(fluhexafon)+TX、氟氯苯菊酯+TX、氟吡菌酰胺+TX、氟戊螨硫醚(flupentiofenox)+TX、氟吡呋喃酮+TX、氟虫啶胺(flupyrimin)+TX、氟雷拉纳(fluralaner)+TX、氟胺氰菊酯+TX、氟噁唑酰胺(fluxametamide)+TX、噻唑膦+TX、γ-三氟氯氰菊酯+TX、戊吡虫胍+TX、氯虫酰肼+TX、苄螨醚+TX、七氟甲醚菊酯(heptafluthrin)+TX、噻螨酮+TX、氟蚁腙+TX、氰咪唑硫磷

(imicyafos)+TX、吡虫啉+TX、炔咪菊酯+TX、吲唑虫酰胺(indazapyroxamet)+TX、茚虫威+TX、碘甲烷+TX、异菌脲+TX、异噁唑虫酰胺(isocycloseram)+TX、异拌磷+TX、伊维菌素+TX、κ-联苯菊酯+TX、κ-七氟菊酯+TX、λ-三氟氯氰菊酯+TX、雷皮菌素+TX、洛替拉纳(lotilaner)+TX、氯芬奴隆+TX、氰氟虫腙+TX、四聚乙醛+TX、威百亩+TX、灭多虫+TX、甲氧虫酰肼+TX、甲氧苄氟菊酯+TX、速灭威+TX、自克威+TX、灭螨菌素+TX、甲氧氟菊酯(momfluorothrin)+TX、灭绦灵+TX、唑虫烟酰胺(nicofluprole)+TX;烯啶虫胺+TX、硝虫噻嗪+TX、氧乐果+TX、杀线威+TX、噁唑磺酰虫啶(oxazosulfyl)+TX、对硫磷-乙基+TX、苄氯菊酯+TX、苯醚菊酯+TX、磷虫威+TX、胡椒基丁醚+TX、抗蚜威+TX、嘧啶磷-乙基+TX、嘧啶磷-甲基(pirimiphos-methyl)+TX、多角体病毒+TX、炔丙菊酯+TX、丙溴磷+TX、丙氟菊酯+TX、克螨特+TX、胺丙畏+TX、残杀威+TX、丙硫磷+TX、氟苯醚菊酯(protrifenbute)+TX、吡唑酰苯胺(pyflubumide)+TX、吡蚜酮+TX、吡唑硫磷+TX、啶吡唑虫胺(pyrafluprole)+TX、哒螨灵+TX、啶虫丙醚+TX、吡氟喹虫唑(pyrifluquinazon)+TX、嘧螨醚+TX、嘧螨胺(pyriminostrobin)+TX、吡唑虫啶+TX、蚊蝇醚+TX、苄呋菊脂+TX、沙罗拉纳(sarolaner)+TX、司拉克丁+TX、氟硅菊酯+TX、乙基多杀菌素+TX、多杀菌素+TX、螺螨双酯(spirobudifen)+TX;螺螨酯+TX、螺甲螨酯+TX、甲氧哌啶乙酯(spiropidion)+TX、螺虫乙酯+TX、二螺虫(spidoxamat)+TX、砜虫啶+TX、虫酰肼+TX、吡螨胺+TX、丁基嘧啶磷(tebupirimiphos)+TX、七氟菊酯+TX、双硫磷+TX、四氯虫酰胺+TX、四氯杀螨砜(tetradiphon)+TX、胺菊酯+TX、四氟醚菊酯+TX、杀螨素+TX、氟氰虫酰胺+TX、θ-氯氰菊酯+TX、噻虫啉+TX、噻虫嗪+TX、杀虫环+TX、硫双威+TX、久效威+TX、甲基乙拌磷+TX、杀虫磺丙烷+TX、替戈拉纳(tigolaner)+TX、硫虫酰胺(tiorantraniliprole)+TX;线噻吩(tioxazafen)+TX、唑虫酰胺+TX、毒杀芬+TX、四溴菊酯+TX、四氟苯菊酯+TX、唑蚜威+TX、三唑磷+TX、敌百虫+TX、毒壤磷+TX、敌百虫+TX、三氟杀线酯(trifluenfuronate)+TX、三氟苯嘧啶(triflumezopyrim)+TX、氯吡唑虫胺(Tyclopyrazoflor)+TX、ζ-氯氰菊酯+TX、海藻提取物和衍生自糖酰的发酵产物+TX、海藻提取物和衍生自糖酰的发酵产物(包含脲+TX、氨基酸+TX、钾和钼以及EDTA螯合锰)+TX、海藻提取物和发酵的植物产物+TX、海藻提取物和发酵的植物产物(包含植物激素+TX、维生素+TX、EDTA螯合铜+TX、锌+TX、以及铁+TX)、印楝素+TX、芽孢杆菌属鲇泽(Bacillus aizawai)+TX、蚀几丁质芽孢杆菌(Bacillus chitinosporus)AQ746(NRRL登记号B-21 618)+TX、坚强芽孢杆菌+TX、芽孢杆菌属库尔斯塔克(Bacillus kurstaki)+TX、蕈状芽孢杆菌AQ726(NRRL登记号B-21664)+TX、短小芽孢杆菌(NRRL登记号B-30087)+TX、短小芽孢杆菌AQ717(NRRL登记号B-21662)+TX、芽孢杆菌属物种AQ178(ATCC登记号53522)+TX、芽孢杆菌属物种AQ175(ATCC登记号55608)+TX、芽孢杆菌属物种AQ177(ATCC登记号55609)+TX、未指明的枯草芽孢杆菌+TX、枯草芽孢杆菌AQ153(ATCC登记号55614)+TX、枯草芽孢杆菌AQ30002(NRRL登记号B-50421)+TX、枯草芽孢杆菌AQ30004(NRRL登记号B-50455)+TX、枯草芽孢杆菌AQ713(NRRL登记号B-21661)+TX、枯草芽孢杆菌AQ743(NRRL登记号B-21665)+TX、苏云金芽孢杆菌AQ52(NRRL登记号B-21619)+TX、苏云金芽孢杆菌BD#32(NRRL登记号B-21530)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(subspec.kurstaki)BMP 123+TX、球孢白僵菌+TX、D-柠檬烯+TX、颗粒体病毒+TX、康壮素(Harpin)+TX、棉铃虫核型多角体病毒+TX、谷实夜蛾核型多角体病毒+TX、烟芽夜蛾核型多角体病毒+TX、澳洲棉铃虫核型多角体病毒+TX、绿僵菌属物种+TX、恶臭白色真菌(Muscodor albus)620(NRRL登记号30547)+TX、恶臭玫红真菌(Muscodor roseus)A3-5(NRRL登记号

30548)+TX、基于印楝树的产品+TX、玫烟色拟青霉+TX、淡紫色拟青霉+TX、拟斯扎瓦巴氏杆菌+TX、穿刺巴氏杆菌+TX、分枝巴氏杆菌+TX、索雷巴氏杆菌(Pasteuria thornei)+TX、巴氏杆菌+TX、对-伞花烃+TX、小菜蛾颗粒体病毒+TX、小菜蛾核型多角体病毒+TX、多角体病毒+TX、除虫菊+TX、QRD 420(类蛄共混物)+TX、QRD 452(类蛄共混物)+TX、QRD 460(类蛄共混物)+TX、皂树+TX、球状红球菌AQ719(NRRL登记号B-21663)+TX、草地贪夜蛾核型多角体病毒+TX、鲜黄链霉菌(NRRL登记号30232)+TX、链霉菌属物种(NRRL登记号B-30145)+TX、类蛄共混物+TX、以及轮枝孢属物种+TX;

[0841] 杀藻剂,该杀藻剂选自由以下组成的物质组:苯噻噁唑嗪(bethoxazin)[CCN]+TX、二辛酸铜(IUPAC名称)(170)+TX、硫酸铜(172)+TX、环丙藻净(cybutryne)[CCN]+TX、二氯萘醌(dichlone)(1052)+TX、双氯酚(232)+TX、茵多酸(295)+TX、三苯锡(fentin)(347)+TX、熟石灰[CCN]+TX、代森钠(nabam)(566)+TX、灭藻醌(quinoclamine)(714)+TX、醌萍胺(quinonamid)(1379)+TX、西玛津(730)+TX、三苯基乙酸锡(IUPAC名称)(347)和三苯基氢氧化锡(IUPAC名称)(347)+TX;

[0842] 驱蠕虫剂,该驱蠕虫剂选自由以下组成的物质组:阿维菌素(1)+TX、克芦磷酯(1011)+TX、环丁氟仑+TX、多拉克汀(别名)[CCN]+TX、埃玛菌素(291)+TX、埃玛菌素苯甲酸酯(291)+TX、依立诺克丁(别名)[CCN]+TX、伊维菌素(别名)[CCN]+TX、米尔贝肟(milbemycin oxime)(别名)[CCN]+TX、莫昔克丁(别名)[CCN]+TX、哌嗪[CCN]+TX、司拉克丁(别名)[CCN]+TX、多杀菌素(737)和托布津(thiophanate)(1435)+TX;

[0843] 杀鸟剂,该杀鸟剂选自由以下组成的物质组:氯醛糖(127)+TX、异狄氏剂(1122)+TX、倍硫磷(346)+TX、吡啶-4-胺(IUPAC名称)(23)和士的宁(745)+TX;

[0844] 杀细菌剂,该杀细菌剂选自由以下组成的物质组:1-羟基-1H-吡啶-2-硫酮(IUPAC名称)(1222)+TX、4-(喹喔啉-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(别名)[CCN]+TX、春雷霉素(483)+TX、春雷霉素盐酸盐水合物(483)+TX、二(二甲基二硫代氨基甲酸)镍(IUPAC名称)(1308)+TX、三氯甲基吡啶(nitrapyrin)(580)+TX、辛噻酮(octhilinone)(590)+TX、奥索利酸(606)+TX、土霉素(611)+TX、羟基喹啉硫酸钾(446)+TX、噻菌灵(probenazole)(658)+TX、链霉素(744)+TX、链霉素倍半硫酸盐(744)+TX、叶枯酞(766)+TX、和硫柳汞(别名)[CCN]+TX;

[0845] 生物试剂,该生物试剂选自由以下组成的物质组:棉褐带卷蛾GV(别名)(12)+TX、放射形土壤杆菌(别名)(13)+TX、钝绥螨属物种(Amblyseius spp.)(别名)(19)+TX、芹菜夜蛾NPV(别名)(28)+TX、原樱翅缨小蜂(Anagrus atomus)(别名)(29)+TX、短距蚜小蜂(Aphelinus abdominalis)(别名)(33)+TX、棉蚜寄生蜂(Aphidius colemani)(别名)(34)+TX、食蚜瘿蚊(Aphidoletes aphidimyza)(别名)(35)+TX、苜蓿银纹夜蛾NPV(别名)(38)+TX、坚强芽孢杆菌(Bacillus firmus)(别名)(48)+TX、球形芽孢杆菌(Bacillus sphaericus Neide)(学名)(49)+TX、苏云金芽孢杆菌(Bacillus thuringiensis Berliner)(学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌鲇泽亚种(Bacillus thuringiensis subsp.aizawai)(学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌以色列亚种(Bacillus thuringiensis subsp.israelensis)(学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌日本亚种(Bacillus thuringiensis

subsp.japonensis)(学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(Bacillus thuringiensis subsp.kurstaki)(学名)(51)+TX、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种(Bacillus thuringiensis subsp.tenebrionis)(学名)(51)+TX、球孢白僵菌(Beauveria bassiana)(别名)(53)+TX、布氏白僵菌(Beauveria brongniartii)(别名)(54)+TX、普通草蛉(Chrysoperla carnea)(别名)(151)+TX、孟氏隐唇瓢虫(Cryptolaemus montrouzieri)(别名)(178)+TX、苹果蠹蛾GV(别名)(191)+TX、西伯利亚离颚茧蜂(Dacnusa sibirica)(别名)(212)+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂(Diglyphus isaea)(别名)(254)+TX、丽蚜小蜂(Encarsia formosa)(学名)(293)+TX、桨角蚜小蜂(Eretmocerus eremicus)(别名)(300)+TX、谷实夜蛾NPV(别名)(431)+TX、嗜菌异小杆线虫(Heterorhabditis bacteriophora)和大异小杆线虫(H.megidis)(别名)(433)+TX、斑长足瓢虫(Hippodamia convergens)(别名)(442)+TX、橘粉介壳虫寄生蜂(Leptomastix dactylopii)(别名)(488)+TX、盲蝽(Macrolophus caliginosus)(别名)(491)+TX、甘蓝夜蛾NPV(别名)(494)+TX、黄阔柄跳小蜂(Metaphycus helvolus)(别名)(522)+TX、黄绿绿僵菌(Metarhizium anisopliae var.acridum)(学名)(523)+TX、金龟子绿僵菌小孢变种(Metarhizium anisopliae var.anisopliae)(学名)(523)+TX、欧洲新松叶蜂(Neodiprion sertifer)NPV和红头新松叶蜂(N.lecontei)NPV(别名)(575)+TX、小花蝽属物种(别名)(596)+TX、玫烟色拟青霉(Paecilomyces fumosoroseus)(别名)(613)+TX、智利小植绥螨(Phytoseiulus persimilis)(别名)(644)+TX、甜菜夜蛾核多角体病毒(Spodoptera exigua multicapsid nuclear polyhedrosis virus)(学名)(741)+TX、毛蚊线虫(Steinernema bibionis)(别名)(742)+TX、小卷蛾斯氏线虫(Steinernema carpocapsae)(别名)(742)+TX、夜蛾斯氏线虫(别名)(742)+TX、格氏线虫(Steinernema glaseri)(别名)(742)+TX、锐比斯氏线虫(Steinernema riobrave)(别名)(742)+TX、Steinernema riobravis(别名)(742)+TX、蝼蛄斯氏线虫(Steinernema scapterisci)(别名)(742)+TX、斯氏线虫属物种(Steinernema spp.)(别名)(742)+TX、赤眼蜂属物种(别名)(826)+TX、西方盲走螨(Typhlodromus occidentalis)(别名)(844)和蜡蚧轮枝菌(Verticillium lecanii)(别名)(848)+TX;

[0846] 土壤消毒剂,该土壤消毒剂选自由以下组成的物质组:碘甲烷(IUPAC名称)(542)和溴甲烷(537)+TX;

[0847] 化学不育剂,该化学不育剂选自由以下组成的物质组:唑磷嗪(apholate)[CCN]+TX、不孕甲胺(bisazir)(别名)[CCN]+TX、白消安(别名)[CCN]+TX、除虫脲(250)+TX、不孕胺(别名)[CCN]+TX、六甲蜜胺(hemel)[CCN]+TX、六甲磷(hempa)[CCN]+TX、甲基涕巴(metepa)[CCN]+TX、甲硫涕巴(methiotepa)[CCN]+TX、甲基唑磷嗪(methyl apholate)[CCN]+TX、不孕啶(morzid)[CCN]+TX、氟幼脲(penfluron)(别名)[CCN]+TX、不育胺(tepa)[CCN]+TX、硫代六甲磷(thiohempa)(别名)[CCN]+TX、硫涕巴(别名)[CCN]+TX、曲他胺(别名)[CCN]和尿烷亚胺(别名)[CCN]+TX;

[0848] 昆虫信息素,该昆虫信息素选自由以下组成的物质组:(E)-癸-5-烯-1-基乙酸酯与(E)-癸-5-烯-1-醇(IUPAC名称)(222)+TX、(E)-十三碳-4-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(829)+TX、(E)-6-甲基庚-2-烯-4-醇(IUPAC名称)(541)+TX、(E,Z)-十四碳-4,10-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(779)+TX、(Z)-十二碳-7-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(285)+TX、(Z)-十六碳-11-烯醛(IUPAC名称)(436)+TX、(Z)-十六碳-11-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)

(437)+TX、(Z)-十六碳-13-烯-11-炔-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(438)+TX、(Z)-二十-13-烯-10-酮(IUPAC名称)(448)+TX、(Z)-十四碳-7-烯-1-醛(IUPAC名称)(782)+TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-醇(IUPAC名称)(783)+TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(784)+TX、(7E,9Z)-十二碳-7,9-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(283)+TX、(9Z,11E)-十四碳-9,11-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(780)+TX、(9Z,12E)-十四碳-9,12-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(781)+TX、14-甲基十八碳-1-烯(IUPAC名称)(545)+TX、4-甲基壬-5-醇与4-甲基壬-5-酮(IUPAC名称)(544)+TX、α-多纹素(alpha-multistriatin)(别名)[CCN]+TX、西部松小蠹集合信息素(brevicomin)(别名)[CCN]+TX、十二碳二烯醇(codlelure)(别名)[CCN]+TX、可得蒙(codlemone)(别名)(167)+TX、诱蝇酮(cuelure)(别名)(179)+TX、环氧十九烷(disparlure)(277)+TX、十二碳-8-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(286)+TX、十二碳-9-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(287)+TX、十二碳-8+TX、10-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(284)+TX、多米诱剂(dominicalure)(别名)[CCN]+TX、4-甲基辛酸乙酯(IUPAC名称)(317)+TX、丁香酚(别名)[CCN]+TX、南部松小蠹集合信息素(frontalin)(别名)[CCN]+TX、**Gossyplure®**(别名;十六碳-7,11-二烯-1-基-乙酸酯)的(Z,E)和(Z,Z)异构体的1:1混合物(420)+TX、诱杀烯混剂(grandlure)(421)+TX、诱杀烯混剂I(别名)(421)+TX、诱杀烯混剂II(别名)(421)+TX、诱杀烯混剂III(别名)(421)+TX、诱杀烯混剂IV(别名)(421)+TX、己诱剂(hexalure)[CCN]+TX、齿小蠹二烯醇(ipsdienol)(别名)[CCN]+TX、小蠹烯醇(ipsenol)(别名)[CCN]+TX、金龟子性诱剂(japonilure)(别名)(481)+TX、三甲基二氧三环壬烷(lineatin)(别名)[CCN]+TX、夜蛾性诱剂(litlure)(别名)[CCN]+TX、粉纹夜蛾性诱剂(looplure)(别名)[CCN]+TX、诱杀酯(medlure)[CCN]+TX、美加特酸(megatomoic acid)(别名)[CCN]+TX、诱虫醚(诱虫醚)(别名)(540)+TX、诱虫烯(muscalure)(563)+TX、十八碳-2,13-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(588)+TX、十八碳-3,13-二烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(589)+TX、欧福绿(orfralure)(别名)[CCN]+TX、椰蛀犀金龟聚集信息素(oryctalure)(别名)(317)+TX、非乐康(ostramone)(别名)[CCN]+TX、诱虫环(siglure)[CCN]+TX、香蕉球茎象鼻虫引诱剂(sordidin)(别名)(736)+TX、食菌甲诱醇(sulcatol)(别名)[CCN]+TX、十四碳-11-烯-1-基乙酸酯(IUPAC名称)(785)+TX、地中海实蝇引诱剂(839)+TX、地中海实蝇引诱剂A(别名)(839)+TX、地中海实蝇引诱剂B_1(别名)(839)+TX、地中海实蝇引诱剂B_2(别名)(839)+TX、地中海实蝇引诱剂C(别名)(839)和trunc-call(别名)[CCN]+TX;

[0849] 昆虫驱避剂,该昆虫驱避剂选自由以下组成的物质组:2-(辛基硫代)乙醇(IUPAC名称)(591)+TX、避蚊酮(butopyronoxyl)(933)+TX、丁氧基(聚丙二醇)(936)+TX、己二酸二丁酯(IUPAC名称)(1046)+TX、邻苯二甲酸二丁酯(1047)+TX、丁二酸二丁酯(IUPAC名称)(1048)+TX、避蚊胺[CCN]+TX、驱蚊灵(dimethyl carbate)[CCN]+TX、邻苯二甲酸二甲酯[CCN]+TX、乙基己二醇(1137)+TX、己脲(hexamide)[CCN]+TX、甲喹丁酯(methoquin-butyl)(1276)+TX、甲基新癸酰胺[CCN]+TX、草氨酸盐(oxamate)[CCN]和羟哌酯[CCN]+TX;

[0850] 杀软体动物剂,该杀软体动物剂选自由以下组成的物质组:二(三丁基锡)氧化物(IUPAC名称)(913)+TX、溴乙酰胺[CCN]+TX、砷酸钙[CCN]+TX、除线威(999)+TX、乙酰亚砷酸铜[CCN]+TX、硫酸铜(172)+TX、三苯锡(347)+TX、磷酸铁(IUPAC名称)(352)+TX、四聚乙醛(518)+TX、灭虫威(530)+TX、氯硝柳胺(576)+TX、氯硝柳胺-乙醇胺(576)+TX、五氯酚(623)+TX、五氯苯氧化钠(623)+TX、噻螨威(tazimcarb)(1412)+TX、硫双威(799)+TX、三丁基氧化

锡(913)+TX、蜗螺杀(trifenmorph)(1454)+TX、混杀威(trimethacarb)(840)+TX、三苯基乙酸锡(IUPAC名称)(347)和三苯基氢氧化锡(IUPAC名称)(347)+TX、吡唑虫啶(pyriprole)[394730-71-3]+TX;

[0851] 杀线虫剂,该杀线虫剂选自由以下组成的物质组:AKD-3088(化合物代码)+TX、1,2-二溴-3-氯丙烷(IUPAC/化学文摘名称)(1045)+TX、1,2-二氯丙烷(IUPAC/化学文摘名称)(1062)+TX、1,2-二氯丙烷与1,3-二氯丙烯(IUPAC名称)(1063)+TX、1,3-二氯丙烯(233)+TX、3,4-二氯四氢噻吩1,1-二氧化物(IUPAC/化学文摘名称)(1065)+TX、3-(4-氯苯基)-5-甲基罗丹宁(IUPAC名称)(980)+TX、5-甲基-6-硫代-1,3,5-噻二嗪-3-基乙酸(IUPAC名称)(1286)+TX、6-异戊烯基氨基嘌呤(别名)(210)+TX、阿维菌素(1)+TX、乙酰虫腈[CCN]+TX、棉铃威(15)+TX、涕灭威(aldicarb)(16)+TX、涕灭砜威(863)+TX、AZ 60541(化合物代码)+TX、杀线噻唑(benclothiaz)[CCN]+TX、苯菌灵(62)+TX、丁基哒螨灵(别名)+TX、克线丹(109)+TX、克百威(carbofuran)(118)+TX、二硫化碳(945)+TX、丁硫克百威(119)+TX、氯化苦(141)+TX、毒死蜱(145)+TX、除线威(999)+TX、环丁氟仑+TX、细胞分裂素(别名)(210)+TX、棉隆(216)+TX、DBCP(1045)+TX、DCIP(218)+TX、除线特(diamidafos)(1044)+TX、除线磷(1051)+TX、二克磷(dicliphos)(别名)+TX、乐果(262)+TX、多拉克汀(别名)[CCN]+TX、埃玛菌素(291)+TX、埃玛菌素苯甲酸酯(291)+TX、依立诺克丁(别名)[CCN]+TX、灭线磷(312)+TX、二溴乙烷(316)+TX、苯线磷(326)+TX、吡螨胺(fenpyrad)(别名)+TX、丰索磷(1158)+TX、噻唑磷(408)+TX、丁硫环磷(1196)+TX、糠醛(别名)[CCN]+TX、GY-81(研究代码)(423)+TX、速杀硫磷[CCN]+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、克线磷胺(isamidofos)(1230)+TX、氯唑磷(1231)+TX、伊维菌素(别名)[CCN]+TX、激动素(别名)(210)+TX、甲基减蚜磷(1258)+TX、威百亩(519)+TX、威百亩钾盐(别名)(519)+TX、威百亩钠盐(519)+TX、溴甲烷(537)+TX、异硫氰酸甲酯(543)+TX、米尔贝肟(别名)[CCN]+TX、莫昔克丁(别名)[CCN]+TX、疣孢漆斑菌(Myrothecium verrucaria)组合物(别名)(565)+TX、NC-184(化合物代码)+TX、杀线威(602)+TX、甲拌磷(636)+TX、磷胺(639)+TX、磷虫威[CCN]+TX、克线丹(别名)+TX、司拉克丁(别名)[CCN]+TX、多杀菌素(737)+TX、叔丁威(别名)+TX、特丁磷(773)+TX、四氯噻吩(IUPAC/化学文摘名称)(1422)+TX、噻吩诺(thiafenox)(别名)+TX、虫线磷(1434)+TX、三唑磷(820)+TX、唑蚜威(triazuron)(别名)+TX、二甲苯酚[CCN]+TX、YI-5302(化合物代码)和玉米素(别名)(210)+TX、氟噻虫砜(fluensulfone)[318290-98-1]+TX、氟吡菌酰胺+TX;

[0852] 硝化抑制剂,该硝化抑制剂选自由以下组成的物质组:乙基黄原酸钾[CCN]和氯啶(nitrapyrin)(580)+TX;

[0853] 植物活化剂,该植物活化剂选自由以下组成的物质组:阿拉酸式苯(acibenzolar)(6)+TX、阿拉酸式苯-S-甲基(6)+TX、噻菌灵(probenazole)(658)和大虎杖(Reynoutria sachalinensis)提取物(别名)(720)+TX;

[0854] 杀鼠剂,该杀鼠剂选自由以下组成的物质组: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(包括α-溴敌隆)+TX、溴鼠胺(92)+TX、氰化钙(444)+TX、氯醛糖(127)+TX、氯鼠酮(140)+TX、胆钙化醇(别名)(850)+TX、氯灭鼠灵(1004)+TX、克灭鼠(1005)+TX、杀鼠萘(175)+TX、杀鼠嘧啶(1009)+TX、鼠得克(246)+TX、噻鼠灵(249)+TX、敌鼠(273)+

TX、钙化醇(301)+TX、氟鼠灵(357)+TX、氟乙酰胺(379)+TX、氟鼠啶(1183)+TX、氟鼠啶盐酸盐(1183)+TX、γ-HCH(430)+TX、HCH(430)+TX、氰化氢(444)+TX、碘甲烷(IUPAC名称)(542)+TX、林丹(430)+TX、磷化镁(IUPAC名称)(640)+TX、溴甲烷(537)+TX、鼠特灵(1318)+TX、毒鼠磷(1336)+TX、磷化氢(IUPAC名称)(640)+TX、磷[CCN]+TX、杀鼠酮(1341)+TX、亚砷酸钾[CCN]+TX、灭鼠优(1371)+TX、海葱糖苷(1390)+TX、亚砷酸钠[CCN]+TX、氰化钠(444)+TX、氟乙酸钠(735)+TX、士的宁(745)+TX、硫酸铊[CCN]+TX、杀鼠灵(851)以及磷化锌(640)+TX;

[0855] 增效剂,该增效剂选自由以下组成的物质组:2-(2-丁氧基乙氧基)乙基胡椒酸酯(IUPAC名称)(934)+TX、5-(1,3-苯并间二氧杂环戊烯-5-基)-3-己基环己-2-烯酮(IUPAC名称)(903)+TX、具有橙花叔醇的法呢醇(别名)(324)+TX、MB-599(研究代码)(498)+TX、MGK 264(研究代码)(296)+TX、增效醚(piperonyl butoxide)(649)+TX、增效醛(piprotal)(1343)+TX、增效酯(propyl isomer)(1358)+TX、S421(研究代码)(724)+TX、增效散(sesamex)(1393)+TX、芝麻林素(sesasmolin)(1394)和亚砜(1406)+TX;

[0856] 动物驱避剂,该动物驱避剂选自由以下组成的物质组:蒽醌(32)+TX、氯醛糖(127)+TX、环烷酸铜[CCN]+TX、王铜(171)+TX、二嗪磷(227)+TX、二环戊二烯(化学名称)(1069)+TX、双胍辛盐(guazatine)(422)+TX、双胍辛乙酸盐(422)+TX、灭虫威(530)+TX、吡啶-4-胺(IUPAC名称)(23)+TX、福美双(804)+TX、混杀威(trimethacarb)(840)+TX、环烷酸锌[CCN]和福美锌(856)+TX;

[0857] 杀病毒剂,该杀病毒剂选自由以下组成的物质组:洁尔灭(imanin)(别名)[CCN]和利巴韦林(别名)[CCN]+TX;

[0858] 创伤保护剂,该创伤保护剂选自由以下组成的物质组:氧化汞(512)+TX、辛噻酮(octhilinone)(590)和甲基托布津(802)+TX;

[0859] 生物活性物质,该生物活性物质选自:1,1-双(4-氯-苯基)-2-乙氧基乙醇+TX、2,4-二氯苯基苯磺酸酯+TX、2-氟-N-甲基-N-1-萘乙酰胺+TX、4-氯苯基苯砜+TX、乙酰虫腈+TX、涕灭砜威+TX、赛果+TX、果满磷+TX、胺吸磷+TX、草酸氢胺吸磷+TX、双甲脒+TX、杀螨特+TX、三氧化二砷+TX、偶氮苯+TX、偶氮磷+TX、苯菌灵+TX、苯诺沙磷+TX、苯甲酸苄酯+TX、联苯吡菌胺+TX、溴灭菊酯+TX、溴烯杀+TX、溴硫磷+TX、溴螨酯+TX、噻嗪酮+TX、丁酮威+TX、丁酮砜威+TX、丁基哒螨灵+TX、多硫化钙+TX、八氯苊烯+TX、氯灭杀威+TX、三硫磷+TX、螨蜱胺+TX、灭螨猛+TX、杀螨醚+TX、杀虫脒+TX、杀虫脒盐酸盐+TX、杀螨醇+TX、杀螨酯+TX、敌螨特+TX、乙酯杀螨醇+TX、灭螨脒+TX、灭虫脲+TX、丙酯杀螨醇+TX、虫螨磷+TX、瓜菊酯I+TX、瓜菊酯II+TX、瓜菊酯+TX、克罗散泰+TX、蝇毒磷+TX、克罗米通+TX、巴毒磷+TX、硫杂灵+TX、果虫磷+TX、DCPM+TX、DDT+TX、田乐磷+TX、田乐磷-O+TX、田乐磷-S+TX、内吸磷-甲基+TX、内吸磷-O+TX、内吸磷-O-甲基+TX、内吸磷-S+TX、内吸磷-S-甲基+TX、磺吸磷(demeton-S-methylsulfon)+TX、抑菌灵+TX、敌敌畏+TX、二克磷+TX、除螨灵+TX、甲氟磷+TX、消螨酚(dinex)+TX、消螨酚(dinex-diclexine)+TX、敌螨普-4+TX、敌螨普-6+TX、邻敌螨消+TX、硝戊酯+TX、硝辛酯杀螨剂+TX、硝丁酯+TX、敌杀磷+TX、磺基二苯+TX、戒酒硫+TX、DNOC+TX、苯氧炔螨+TX、多拉克汀+TX、因毒磷+TX、依立诺克丁+TX、益硫磷+TX、乙嘧硫磷+TX、抗螨唑+TX、苯丁锡+TX、苯硫威+TX、吡螨胺(fenpyrad)+TX、唑螨酯+TX、胺苯吡菌酮+TX、除螨酯+TX、氟硝二苯胺+TX、氟螨噻+TX、氟螨脲+TX、联氟螨+TX、氟杀螨+TX、FMC 1137+TX、伐虫脒+TX、伐虫脒盐酸盐+TX、胺甲威+TX、γ-HCH+TX、果绿定+TX、苄螨醚+TX、十六烷基环丙烷羧酸酯+

TX、水胺硫磷+TX、茉莉菊酯I+TX、茉莉菊酯II+TX、碘硫磷+TX、林丹+TX、丙螨氰+TX、灭蚜磷+TX、二噻磷+TX、甲硫芬+TX、虫螨畏+TX、溴甲烷+TX、速灭威+TX、自克威+TX、米尔贝肟+TX、丙胺氟+TX、久效磷+TX、茂果+TX、莫昔克丁+TX、二溴磷+TX、4-氯-2-(2-氯-2-甲基-丙基)-5-[(6-碘-3-吡啶基)甲氧基]哒嗪-3-酮+TX、氟蚁灵+TX、尼可霉素+TX、戊氰威+TX、戊氰威1:1氯化锌络合物+TX、氧乐果+TX、亚异砜磷+TX、砜拌磷+TX、pp'-DDT+TX、对硫磷+TX、苄氯菊酯+TX、芬硫磷+TX、伏杀磷+TX、硫环磷+TX、磷胺+TX、氯化松节油+TX、杀螨素+TX、丙氯诺+TX、蜱虱威+TX、残杀威+TX、乙噻唑磷+TX、发疏磷+TX、除虫菊酯I+TX、除虫菊酯II+TX、除虫菊酯+TX、哒嗪硫磷+TX、嘧硫磷+TX、喹硫磷+TX、喹硫磷+TX、R-1492+TX、甘氨硫磷+TX、鱼藤酮+TX、八甲磷+TX、克线丹+TX、司拉克丁+TX、苏硫磷+TX、SSI-121+TX、舒非仑+TX、氟虫胺+TX、硫特普+TX、硫+TX、氟螨嗪+TX、τ-氟胺氰菊酯+TX、TEPP+TX、叔丁威+TX、四氯杀螨砜+TX、杀螨好+TX、塞芬诺克斯(thiafenox)+TX、抗虫威+TX、久效威+TX、甲基乙拌磷+TX、克杀螨+TX、苏力菌素+TX、威菌磷+TX、苯螨噻+TX、三唑磷+TX、灭蚜唑+TX、三氯丙氧磷+TX、三活菌素+TX、蚜灭多+TX、甲烯氟虫腈+TX、百杀辛+TX、二辛酸铜+TX、硫酸铜+TX、环丙藻净+TX、二氯萘醌+TX、双氯酚+TX、茵多酸+TX、三苯锡+TX、熟石灰+TX、代森钠+TX、灭藻醌+TX、醌萍胺+TX、西玛津+TX、三苯基乙酸锡+TX、三苯基氢氧化锡+TX、育畜磷+TX、哌嗪+TX、托布津+TX、氯醛糖+TX、倍硫磷+TX、吡啶-4-胺+TX、士的宁+TX、1-羟基-1H-吡啶-2-硫酮+TX、4-(喹喔啉-2-基氨基)苯磺酰胺+TX、8-羟基喹啉硫酸盐+TX、溴硝醇+TX、氢氧化铜+TX、甲酚+TX、双吡硫翁+TX、多地辛+TX、敌磺钠+TX、甲醛+TX、汞加芬+TX、春雷霉素+TX、春雷霉素盐酸盐水合物+TX、二(二甲基二硫代氨基甲酸)镍+TX、三氯甲基吡啶+TX、辛噻酮+TX、奥索利酸+TX、土霉素+TX、羟基喹啉硫酸钾+TX、噻菌灵+TX、链霉素+TX、链霉素倍半硫酸盐+TX、叶枯酞+TX、硫柳汞+TX、棉褐带卷蛾GV+TX、放射形土壤杆菌+TX、钝绥螨属物种+TX、芹菜夜蛾NPV+TX、原樱翅缨小蜂+TX、短距蚜小蜂+TX、棉蚜寄生蜂+TX、食蚜瘿蚊+TX、苜蓿银纹夜蛾NPV+TX、球形芽孢杆菌+TX、布氏白僵菌+TX、普通草蛉+TX、孟氏隐唇瓢虫+TX、苹果蠹蛾GV+TX、西伯利亚离颚茧蜂+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂+TX、丽蚜小蜂+TX、桨角蚜小蜂+TX、嗜菌异小杆线虫(Heterorhabditis bacteriophora)和大异小杆线虫(H.megidis)+TX、斑长足瓢虫+TX、橘粉介壳虫寄生蜂+TX、盲蝽+TX、甘蓝夜蛾NPV+TX、黄阔柄跳小蜂+TX、黄绿绿僵菌+TX、金龟子绿僵菌小孢变种+TX、欧洲新松叶蜂(Neodiprion sertifer)NPV和红头新松叶蜂(N.lecontei)NPV+TX、小花蝽属物种+TX、玫烟色拟青霉+TX、智利小植绥螨+TX、毛蚊线虫+TX、小卷蛾斯氏线虫+TX、夜蛾斯氏线虫+TX、格氏线虫+TX、锐比斯氏线虫+TX、Steinernema riobravis+TX、蒌蛄斯氏线虫+TX、斯氏线虫属物种+TX、赤眼蜂属物种+TX、西方盲走螨+TX、蜡蚧轮枝菌+TX、唑磷嗪+TX、双(氮丙啶)甲氨基膦硫化物(bisazir)+TX、白消安+TX、迪麦替夫+TX、六甲蜜胺+TX、六甲磷+TX、甲基涕巴+TX、甲硫涕巴+TX、甲基唑磷嗪+TX、不孕啶+TX、氟幼脲+TX、涕巴+TX、硫代六甲磷+TX、硫涕巴+TX、曲他胺+TX、尿烷亚胺(uredepa)+TX、(E)-癸-5-烯-1-基乙酸酯与(E)-癸-5-烯-1-醇+TX、(E)-十三碳-4-烯-1-基乙酸酯+TX、(E)-6-甲基庚-2-烯-4-醇+TX、(E,Z)-十四碳-4,10-二烯-1-基乙酸酯+TX、(Z)-十二碳-7-烯-1-基乙酸酯+TX、(Z)-十六碳-11-烯醛+TX、(Z)-十六碳-11-烯-1-基乙酸酯+TX、(Z)-十六碳-13-烯-11-炔-1-基乙酸酯+TX、(Z)-二十-13-烯-10-酮+TX、(Z)-十四碳-7-烯-1-醛+TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-醇+TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-基乙酸酯+TX、(7E,9Z)-十二碳-7,9-二烯-1-基乙酸酯+TX、(9Z,11E)-十四碳-9,11-二烯-1-基乙酸酯+TX、(9Z,12E)-十四碳-9,12-二烯-

1-基乙酸酯+TX、14-甲基十八碳-1-烯+TX、4-甲基壬-5-醇与4-甲基壬-5-酮+TX、α-多纹素+TX、西部松小蠹集合信息素+TX、十二碳二烯醇+TX、可得蒙+TX、诱蝇酮+TX、环氧十九烷+TX、十二碳-8-烯-1-基乙酸酯+TX、十二碳-9-烯-1-基乙酸酯+TX、十二碳-8+TX、10-二烯-1-基乙酸酯+TX、多米诱剂+TX、4-甲基辛酸乙酯+TX、丁香酚+TX、南部松小蠹集合信息素+TX、诱杀烯混剂+TX、诱杀烯混剂I+TX、诱杀烯混剂II+TX、诱杀烯混剂III+TX、诱杀烯混剂IV+TX、己诱剂+TX、齿小蠹二烯醇+TX、小蠹烯醇+TX、金龟子性诱剂+TX、三甲基二氧三环壬烷+TX、夜蛾性诱剂(litlure)+TX、粉纹夜蛾性诱剂+TX、诱杀酯+TX、美加特酸+TX、诱虫醚+TX、诱虫烯+TX、十八碳-2,13-二烯-1-基乙酸酯+TX、十八碳-3,13-二烯-1-基乙酸酯+TX、贺康彼+TX、椰蛀犀金龟聚集信息素+TX、非乐康+TX、诱虫环+TX、香蕉球茎象鼻虫引诱剂(sordidin)+TX、食菌甲诱醇+TX、十四碳-11-烯-1-基乙酸酯+TX、地中海实蝇引诱剂+TX、地中海实蝇引诱剂A+TX、地中海实蝇引诱剂B_1+TX、地中海实蝇引诱剂B_2+TX、地中海实蝇引诱剂C+TX、trunc-call+TX、2-(辛基硫代)乙醇+TX、避蚊酮+TX、丁氧基(聚丙二醇)+TX、己二酸二丁酯+TX、邻苯二甲酸二丁酯+TX、丁二酸二丁酯+TX、避蚊胺+TX、驱蚊灵+TX、邻苯二甲酸二甲酯+TX、乙基己二醇+TX、己脲+TX、甲喹丁+TX、甲基新癸酰胺+TX、草氨酸盐+TX、派卡瑞丁+TX、1-二氯-1-硝基乙烷+TX、1,1-二氯-2,2-二(4-乙基苯基)乙烷+TX、1,2-二氯丙烷与1,3-二氯丙烯+TX、1-溴-2-氯乙烷+TX、2,2,2-三氯-1-(3,4-二氯苯基)乙基乙酸酯+TX、2,2-二氯乙烯基2-乙基亚磺酰基乙基甲基磷酸酯+TX、2-(1,3-二硫戊环-2-基)苯基二甲基氨基甲酸酯+TX、2-(2-丁氧基乙氧基)乙基硫氰酸酯+TX、2-(4,5-二甲基-1,3-二氧戊环-2-基)苯基甲基氨基甲酸酯+TX、2-(4-氯-3,5-二甲苯基氧基)乙醇+TX、2-氯乙烯基二乙基磷酸酯+TX、2-咪唑啉酮+TX、2-异戊酰茚满-1,3-二酮+TX、2-甲基(丙-2-炔基)氨基苯基甲基氨基甲酸酯+TX、2-氰硫基乙基月桂酸酯+TX、3-溴-1-氯丙-1-烯+TX、3-甲基-1-苯基吡唑-5-基二甲基氨基甲酸酯+TX、4-甲基(丙-2-炔基)氨基-3,5-二甲苯基甲基氨基甲酸酯+TX、5,5-二甲基-3-氧代环己-1-烯基二甲基氨基甲酸酯+TX、阿赛硫磷+TX、丙烯腈+TX、艾氏剂+TX、阿洛氨菌素+TX、除害威+TX、α-蜕化素+TX、磷化铝+TX、灭害威+TX、新烟碱+TX、乙基杀扑磷+TX、甲基吡啶磷+TX、苏云金芽孢杆菌δ-内毒素+TX、六氟硅酸钡+TX、多硫化钡+TX、熏菊酯+TX、拜耳22/190+TX、拜耳22408+TX、β-氟氯氰菊酯+TX、β-氯氰菊酯+TX、戊环苄呋菊酯+TX、生物氯菊酯+TX、双(2-氯乙基)醚+TX、硼砂+TX、溴苯烯磷+TX、溴-DDT+TX、合杀威+TX、畜虫威+TX、特嘧硫磷+TX、丁酯磷+TX、砷酸钙+TX、氰化钙+TX、二硫化碳+TX、四氯化碳+TX、巴丹盐酸盐+TX、瑟瓦定+TX、冰片丹+TX、氯丹+TX、十氯酮+TX、氯仿+TX、氯化苦+TX、氯腈肟磷+TX、氯吡唑磷+TX、顺式苄呋菊酯(cis-resmethrin)+TX、顺式苄呋菊酯(cismethrin)+TX、氰菊酯+TX、乙酰亚砷酸铜+TX、砷酸铜+TX、油酸铜+TX、畜虫磷+TX、冰晶石+TX、CS 708+TX、苯腈磷+TX、杀螟腈+TX、环虫菊+TX、赛灭磷+TX、d-胺菊酯+TX、DAEP+TX、棉隆+TX、脱甲基克百威+TX、除线特+TX、异氯磷+TX、除线磷+TX、混甲苯甲氨基甲酸酯(dicresyl)+TX、环虫腈+TX、狄氏剂+TX、二乙基5-甲基吡唑-3-基磷酸酯+TX、喘定+TX、四氟甲醚菊酯+TX、地麦威+TX、苄菊酯+TX、甲基毒虫畏+TX、敌蝇威+TX、丙硝酚+TX、戊硝酚+TX、地乐酚+TX、苯虫醚+TX、蔬果磷+TX、噻唑磷+TX、DSP+TX、脱皮甾酮+TX、EI 1642+TX、EMPC+TX、EPBP+TX、丙硫氧磷(etaphos)+TX、乙硫苯威+TX、甲酸乙酯+TX、二溴乙烷+TX、二氯乙烷+TX、环氧乙烷+TX、EXD+TX、皮蝇磷+TX、乙苯威+TX、杀螟硫磷+TX、氧嘧酰胺+TX、吡氯氰菊酯+TX、丰索磷+TX、乙基倍硫磷+TX、氟氯双苯隆+TX、丁苯硫磷+TX、磷砒酯+TX、丁环硫磷+TX、呋线威+TX、抗虫菊+TX、双胍辛盐+TX、双胍辛乙

酸盐+TX、四硫代碳酸钠+TX、苄螨醚+TX、HCH+TX、HEOD+TX、七氯+TX、速杀硫磷+TX、HHDN+TX、氰化氢+TX、喹啉威+TX、IPSP+TX、氯唑磷+TX、碳氯灵+TX、异艾氏剂+TX、异柳磷+TX、移栽灵+TX、稻瘟灵+TX、恶唑磷+TX、保幼激素I+TX、保幼激素II+TX、保幼激素III+TX、氯戊环+TX、烯虫炔酯+TX、砷酸铅+TX、溴苯磷+TX、啶虫磷+TX、噻唑磷+TX、间异丙苯基甲基氨基甲酸酯+TX、磷化镁+TX、叠氮磷+TX、甲基减蚜磷+TX、灭蚜硫磷+TX、氯化亚汞+TX、甲亚砜磷+TX、威百亩+TX、威百亩钾盐+TX、威百亩钠盐+TX、甲基磺酰氟+TX、丁烯胺磷+TX、甲氧普林+TX、甲醚菊酯+TX、甲氧滴滴涕+TX、异硫氰酸甲酯+TX、甲基氯仿+TX、二氯甲烷+TX、恶虫酮+TX、灭蚁灵+TX、奈肽磷+TX、萘+TX、NC-170+TX、烟碱+TX、硫酸烟碱+TX、硝虫噻嗪+TX、降烟碱+TX、O-5-二氯-4-碘代苯基O-乙基乙基硫代膦酸酯+TX、O,O-二乙基O-4-甲基-2-氧代-2H-苯并吡喃-7-基硫代膦酸酯+TX、O,O-二乙基O-6-甲基-2-丙基嘧啶-4-基硫代膦酸酯+TX、O,O,O',O'-四丙基二硫代焦磷酸酯+TX、油酸+TX、对-二氯苯+TX、甲基对硫磷+TX、五氯苯酚+TX、月桂酸五氯苯酯+TX、PH 60-38+TX、芬硫磷+TX、对氯硫磷+TX、磷化氢+TX、甲基辛硫磷+TX、甲胺嘧磷+TX、多氯二环戊二烯异构体+TX、亚砷酸钾+TX、硫氰酸钾+TX、早熟素I+TX、早熟素II+TX、早熟素III+TX、酰胺嘧啶磷+TX、丙氟菊酯+TX、猛杀威+TX、丙硫磷+TX、吡菌磷+TX、反灭虫菊+TX、苦木提取物+TX、喹硫磷-甲基+TX、畜宁磷+TX、碘柳胺+TX、苄呋菊脂+TX、鱼藤酮+TX、噻嗯菊酯+TX、鱼尼汀+TX、利阿诺定+TX、沙巴藜芦+TX、八甲磷+TX、克线丹+TX、SI-0009+TX、噻丙腈+TX、亚砷酸钠+TX、氰化钠+TX、氟化钠+TX、六氟硅酸钠+TX、五氯苯酚钠+TX、硒酸钠+TX、硫氰酸钠+TX、磺苯醚隆+TX、磺苯醚隆钠盐+TX、硫酰氟+TX、硫丙磷+TX、焦油+TX、噻螨威+TX、TDE+TX、丁基嘧啶磷+TX、双硫磷+TX、环戊烯丙菊酯+TX、四氯乙烷+TX、噻氯磷+TX、杀虫环+TX、杀虫环草酸盐+TX、虫线磷+TX、杀虫单+TX、杀虫单钠+TX、四溴菊酯+TX、反氯菊酯+TX、唑蚜威+TX、异皮蝇磷-3+TX、毒壤膦+TX、混杀威+TX、三氟甲氧威+TX、氯啶菌酯+TX、烯虫硫酯+TX、藜芦定+TX、藜芦碱+TX、XMC+TX、ζ-氯氰菊酯+TX、磷化锌+TX、唑虫磷+TX、氯氟醚菊酯+TX、四氟醚菊酯+TX、双(三丁基锡)氧化物+TX、溴乙酰胺+TX、磷酸铁+TX、氯硝柳胺-乙醇胺+TX、三丁基氧化锡+TX、吡吗啉+TX、蜗螺杀+TX、1,2-二溴-3-氯丙烷+TX、1,3-二氯丙烯+TX、3,4-二氯四氢噻吩1,1-二氧化物+TX、3-(4-氯苯基)-5-甲基罗丹宁+TX、5-甲基-6-硫代-1,3,5-噻二嗪-3-基乙酸+TX、6-异戊烯基氨基嘌呤+TX、氟苯腺嘌呤+TX、苯氯噻+TX、细胞分裂素+TX、DCIP+TX、糠醛+TX、异酰胺磷+TX、激动素+TX、疣孢漆斑菌组合物+TX、四氯噻吩+TX、二甲苯酚+TX、玉米素+TX、乙基黄原酸钾+TX、阿拉酸式苯(acibenzolar)+TX、阿拉酸式苯-S-甲基+TX、大虎杖提取物+TX、α-氯代醇+TX、安妥+TX、碳酸钡+TX、双鼠脲+TX、溴鼠隆+TX、溴敌隆+TX、溴鼠胺+TX、氯鼠酮+TX、胆钙化醇+TX、氯杀鼠灵+TX、克灭鼠+TX、杀鼠萘+TX、杀鼠嘧啶+TX、鼠得克+TX、噻鼠灵+TX、敌鼠+TX、钙化醇+TX、氟鼠灵+TX、氟乙酰胺+TX、氟鼠啶+TX、氟鼠啶盐酸盐+TX、鼠特灵+TX、毒鼠磷+TX、磷+TX、杀鼠酮+TX、灭鼠优+TX、海葱糖苷+TX、氟乙酸钠+TX、硫酸铊+TX、杀鼠灵+TX、2-(2-丁氧基乙氧基)乙基胡椒酸酯+TX、5-(1,3-苯并二氧杂环戊烯-5-基)-3-己基环己-2-烯酮+TX、具有橙花叔醇的法呢醇+TX、增效炔醚+TX、MGK 264+TX、胡椒基丁醚+TX、增效醛+TX、丙基异构体+TX、S421+TX、增效散+TX、芝麻林素+TX、亚砜+TX、蒽醌+TX、环烷酸铜+TX、王铜+TX、二环戊二烯+TX、塞仑+TX、环烷酸锌+TX、福美锌+TX、衣马宁+TX、利巴韦林+TX、氯吲哚酰肼+TX、氧化汞+TX、甲基托布津+TX、阿扎康唑+TX、联苯三唑醇+TX、糠菌唑+TX、环唑醇+TX、苯醚甲环唑+TX、烯唑醇-+TX、氟环唑+TX、腈苯唑+TX、氟喹唑+TX、氟硅唑+TX、粉唑醇+TX、呋吡菌胺+TX、己唑醇+TX、抑霉唑+TX、亚胺

唑+TX、种菌唑+TX、叶菌唑+TX、腈菌唑+TX、多效唑+TX、稻瘟酯+TX、戊菌唑+TX、丙硫菌唑+TX、啶斑肟+TX、咪鲜胺+TX、丙环唑+TX、啶菌唑+TX、-硅氟唑+TX、戊唑醇+TX、氟醚唑+TX、三唑酮+TX、三唑醇+TX、氟菌唑+TX、灭菌唑+TX、嘧啶醇+TX、氯苯嘧啶醇+TX、氟苯嘧啶醇+TX、乙嘧酚磺酸酯+TX、甲菌定+TX、乙菌定+TX、十二环吗啉+TX、苯锈啶+TX、丁苯吗啉+TX、螺环菌胺+TX、十三吗啉+TX、嘧菌环胺+TX、嘧菌胺+TX、嘧霉胺+TX、拌种咯+TX、咯菌腈+TX、苯霜灵+TX、呋霜灵+TX、甲霜灵+TX、R-甲霜灵+TX、呋酰胺+TX、恶霜灵+TX、多菌灵+TX、咪菌威+TX、麦穗宁-+TX、噻苯达唑+TX、乙菌利+TX、菌核利+TX、甲菌利-+TX、腐霉利+TX、乙烯菌核利+TX、啶酰菌胺+TX、萎锈灵+TX、甲呋酰胺+TX、氟酰胺+TX、灭锈胺+TX、氧化萎锈灵+TX、吡噻菌胺+TX、噻呋酰胺+TX、多果定+TX、双胍辛胺+TX、嘧菌酯+TX、醚菌胺+TX、烯肟菌酯+TX、烯肟菌胺+TX、氟菌螨酯+TX、氟嘧菌酯+TX、醚菌酯+TX、苯氧菌胺+TX、肟菌酯+TX、肟醚菌胺+TX、啶氧菌酯+TX、唑菌胺酯+TX、唑胺菌酯+TX、唑菌酯+TX、福美铁+TX、代森锰锌+TX、代森锰+TX、代森联+TX、甲基代森锌+TX、代森锌+TX、敌菌丹+TX、克菌丹+TX、唑呋草+TX、灭菌丹+TX、对甲抑菌灵+TX、波尔多混合剂+TX、氧化铜+TX、代森锰铜+TX、喹啉铜+TX、酞菌酯+TX、克瘟散+TX、异稻瘟净+TX、氯瘟磷+TX、甲基立枯磷+TX、敌菌灵+TX、苯噻菌胺+TX、灭瘟素-S+TX、地茂散-+TX、百菌清+TX、环氟菌胺+TX、霜脲氰+TX、三氟吡啶胺+TX、双氯氰菌胺+TX、哒菌酮-+TX、氯硝胺+TX、乙霉威+TX、烯酰吗啉-+TX、氟吗啉+TX、二噻农+TX、噻唑菌胺+TX、土菌灵+TX、恶唑菌酮+TX、咪唑菌酮+TX、稻瘟酰胺+TX、嘧菌腙+TX、氟啶胺+TX、氟磺菌酮+TX、氟吡菌胺+TX、氟吡菌唑+TX、磺菌胺+TX、氟唑菌酰胺+TX、-环酰菌胺+TX、三乙膦酸铝+TX、恶霉灵+TX、丙森锌+TX、赛座灭+TX、磺菌威+TX、苯菌酮+TX、戊菌隆+TX、苯酞+TX、多氧霉素+TX、霜霉威+TX、吡菌苯威+TX、碘喹唑酮+TX、咯喹酮+TX、苯啶菌酮+TX、喹氧灵+TX、五氯硝基苯+TX、噻酰菌胺+TX、咪唑嗪+TX、三环唑+TX、嗪氨灵+TX、有效霉素+TX、缬菌胺+TX、苯酰菌胺+TX、双炔酰菌胺+TX、氟苯醚酰胺+TX、吡唑萘菌胺+TX、氟唑环菌胺+TX、苯并烯氟菌唑+TX、氟唑菌酰羟胺+TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酸(3',4',5'-三氟-联苯-2-基)-酰胺+TX、异丙氟吡菌胺+TX、异噻菌胺+TX、噻英菌酮+TX、6-乙基-5,7-二氧代-吡咯并[4,5][1,4]二噻英并[1,2-c]异噻唑-3-甲腈+TX、2-(二氟甲基)-N-[3-乙基-1,1-二甲基-茚满-4-基]吡啶-3-甲酰胺+TX、4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基-5-苯基-哒嗪-3-甲腈+TX、(R)-3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[1,1,3-三甲基茚满-4-基]吡唑-4-甲酰胺+TX、4-(2-溴-4-氟-苯基)-N-(2-氯-6-氟-苯基)-2,5-二甲基-吡唑-3-胺+TX、4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺+TX、氟茚唑菌胺+TX、甲香菌酯(jiaxiangjunzhi)+TX、lvbenmixianan+TX、二氯菌噻+TX、曼德斯宾(mandestrobin)+TX、3-(4,4-二氟-3,4-二氢-3,3-二甲基异喹啉-1-基)喹诺酮+TX、2-[2-氟-6-[(8-氟-2-甲基-3-喹啉基)氧基]苯基]丙-2-醇+TX、噻哌菌灵+TX、N-[6-[[[(1-甲基四唑-5-基)-苯基-亚甲基]氨基]氧基甲基]-2-吡啶基]氨基甲酸叔丁酯+TX、联苯吡嗪菌胺+TX、茚吡菌胺+TX、三氟甲氧威(tolprocarb)+TX、氯氟醚菌唑+TX、异三氟菌唑+TX、2-(二氟甲基)-N-[(3R)-3-乙基-1,1-二甲基-茚满-4-基]吡啶-3-甲酰胺+TX、N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-[4-(4,5-二氯噻唑-2-基)氧基-2,5-二甲基-苯基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、[2-[3-[2-[1-[2-[3,5-双(二氟甲基)吡唑-1-基]乙酰基]-4-哌啶基]噻唑-4-基]-4,5-二氢异噁唑-5-基]-3-氯-苯基]甲磺酸盐+TX、N-[6-[[(Z)-[(1-甲基四唑-5-基)-苯基-亚甲基]氨基]氧基甲基]-2-吡啶基]氨基甲酸丁-3-炔酯+TX、N-[[5-[4-(2,4-二甲基苯基)三唑-2-基]-2-

甲基-苯基]甲基]氨基甲酸甲酯+TX、3-氯-6-甲基-5-苯基-4-(2,4,6-三氟苯基)哒嗪+TX、氟苯菌哒嗪+TX、3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[1,1,3-三甲基茚满-4-基]吡唑-4-甲酰胺+TX、1-[2-[[1-(4-氯苯基)吡唑-3-基]氧基甲基]-3-甲基-苯基]-4-甲基-四唑-5-酮+TX、1-甲基-4-[3-甲基-2-[[2-甲基-4-(3,4,5-三甲基吡唑-1-基)苯氧基]甲基]苯基]四唑-5-酮+TX、氨吡菌酯+TX、唑嘧菌胺+TX、吲唑磺菌胺+TX、氟唑菌苯胺+TX、(Z,2E)-5-[1-(4-氯苯基)吡唑-3-基]氧基-2-甲氧基亚氨基-N,3-二甲基-戊-3-烯胺+TX、二氟吡啶菌胺+TX、苯吡克咪德+TX、吡啶草酰胺+TX、异丁乙氧喹啉+TX、异丙菌喹啉+TX、氟菌喹啉+TX、异丙噻菌胺+TX、1-[[4-[[2-(三氟甲基)-1,3-二氧戊环-2-基]甲氧基]苯基]甲基]吡唑-3-甲酸乙酯+TX(可以由WO 2020/056090中所描述的方法制备)、1-[[4-[(Z)-2-乙氧基-3,3,3-三氟-丙-1-烯氧基]苯基]甲基]吡唑-3-甲酸乙酯+TX(可以由WO 2020/056090中所描述的方法制备)、N-[[4-[1-(4-环丙基-2,6-二氟-苯基)吡唑-4-基]-2-甲基-苯基]甲基]氨基甲酸甲酯+TX(可以由WO 2020/097012中所描述的方法制备)、N-[[4-[1-(2,6-二氟-4-异丙基-苯基)吡唑-4-基]-2-甲基-苯基]甲基]氨基甲酸甲酯+TX(可以由WO 2020/097012中所描述的方法制备)、6-氯-3-(3-环丙基-2-氟-苯氧基)-N-[2-(2,4-二甲基苯基)-2,2-二氟-乙基]-5-甲基-哒嗪-4-甲酰胺+TX(可以由WO 2020/109391中所描述的方法制备)、6-氯-N-[2-(2-氯-4-甲基-苯基)-2,2-二氟-乙基]-3-(3-环丙基-2-氟-苯氧基)-5-甲基-哒嗪-4-甲酰胺+TX(可以由WO 2020/109391中所描述的方法制备)、6-氯-3-(3-环丙基-2-氟-苯氧基)-N-[2-(3,4-二甲基苯基)-2,2-二氟-乙基]-5-甲基-哒嗪-4-甲酰胺+TX(可以由WO 2020/109391中所描述的方法制备)、N-[2-[2,4-二氯-苯氧基]苯基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-吡唑-4-甲酰胺+TX、N-[2-[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]苯基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-吡唑-4-甲酰胺+TX、苯噻菌酯+TX、氰烯菌酯+TX、5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇锌盐(2:1)+TX、氟吡菌酰胺+TX、氟菌噁唑+TX、氟噻唑菌腈+TX、氟醚菌酰胺+TX、吡炔虫酰胺+TX、哌碳唑+TX、2-(二氟甲基)-N-(3-乙基-1,1-二甲基-茚满-4-基)吡啶-3-甲酰胺+TX、2-(二氟甲基)-N-((3R)-1,1,3-三甲基茚满-4-基)吡啶-3-甲酰胺+TX、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羟基-3-(1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲腈+TX、四唑菌酮+TX、2-(二氟甲基)-N-((3R)-1,1,3-三甲基茚满-4-基)吡啶-3-甲酰胺+TX、α-(1,1-二甲基乙基)-α-[4'-(三氟甲氧基)[1,1'-二苯基]-4-基]-5-嘧啶甲醇+TX、氟噁菌磺酯+TX、烯肟菌酯+TX、(Z)-3-甲氧基-2-[2-甲基-5-[4-(三氟甲基)三唑-2-基]苯氧基]丙-2-烯酸甲酯+TX、(Z)-3-甲氧基-2-[2-甲基-5-(4-丙基三唑-2-基)苯氧基]丙-2-烯酸甲酯+TX、(Z)-2-[5-(3-异丙基吡唑-1-基)-2-甲基-苯氧基]-3-甲氧基-丙-2-烯酸甲酯+TX、(Z)-3-甲氧基-2-[2-甲基-5-(3-丙基吡唑-1-基)苯氧基]丙-2-烯酸甲酯+TX、(Z)-3-甲氧基-2-[2-甲基-5-[3-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯氧基]丙-2-烯酸甲酯+TX(这些化合物可以由WO 2020/079111中所描述的方法制备)、(Z)-2-(5-环己基-2-甲基-苯氧基)-3-甲氧基-丙-2-烯酸甲酯+TX、(Z)-2-(5-环戊基-2-甲基-苯氧基)-3-甲氧基-丙-2-烯酸甲酯+TX(这些化合物可以由WO 2020/193387中所描述的方法制备)、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羟基-3-(1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲腈+TX、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羟基-3-(5-硫烷基-1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲腈+TX、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羟基-3-(5-硫代-4H-1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲腈+TX、抗倒酯+TX、丁香菌酯+TX、中生菌素+TX、噻菌铜+TX、噻唑锌+TX、阿米托林+TX、异菌脲+TX、辛菌胺+

TX;N'-[5-溴-2-甲基-6-[(1S)-1-甲基-2-丙氧基-乙氧基]-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-[5-溴-2-甲基-6-[(1R)-1-甲基-2-丙氧基-乙氧基]-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-[5-溴-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-[5-氯-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX、N'-[5-溴-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-异丙基-N-甲基-甲脒+TX(这些化合物可以由WO 2015/155075中描述的方法制备);N'-[5-溴-2-甲基-6-(2-丙氧基丙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX(这种化合物可以由IPCOM000249876D中描述的方法制备);N-异丙基-N'-[5-甲氧基-2-甲基-4-(2,2,2-三氟-1-羟基-1-苯基-乙基)苯基]-N-甲基-甲脒+TX、N'-[4-(1-环丙基-2,2,2-三氟-1-羟基-乙基)-5-甲氧基-2-甲基-苯基]-N-异丙基-N-甲基-甲脒+TX(这些化合物可以由WO 2018/228896中描述的方法制备);N-乙基-N'-[5-甲氧基-2-甲基-4-[(2-三氟甲基)氧杂环丁-2-基]苯基]-N-甲基-甲脒+TX、N-乙基-N'-[5-甲氧基-2-甲基-4-[(2-三氟甲基)四氢呋喃-2-基]苯基]-N-甲基-甲脒+TX(这些化合物可以由WO 2019/110427中描述的方法制备);N-[(1R)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1S)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1R)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1S)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1R)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1S)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、8-氟-N-[(1R)-1-[(3-氟苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]喹啉-3-甲酰胺+TX、8-氟-N-[(1S)-1-[(3-氟苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1R)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-[(1S)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-((1R)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基)-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX、N-((1S)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基)-8-氟-喹啉-3-甲酰胺+TX(这些化合物可以由WO 2017/153380中描述的方法制备);1-(6,7-二甲基吡唑并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4,5-三氟-3,3-二甲基-异喹啉+TX、1-(6,7-二甲基吡唑并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4,6-三氟-3,3-二甲基-异喹啉+TX、4,4-二氟-3,3-二甲基-1-(6-甲基吡唑并[1,5-a]吡啶-3-基)异喹啉+TX、4,4-二氟-3,3-二甲基-1-(7-甲基吡唑并[1,5-a]吡啶-3-基)异喹啉+TX、1-(6-氯-7-甲基-吡唑并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-异喹啉+TX(这些化合物可以由WO 2017/025510中描述的方法制备);1-(4,5-二甲基苯并咪唑-1-基)-4,4,5-三氟-3,3-二甲基-异喹啉+TX、1-(4,5-二甲基苯并咪唑-1-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-异喹啉+TX、6-氯-4,4-二氟-3,3-二甲基-1-(4-甲基苯并咪唑-1-基)异喹啉+TX、4,4-二氟-1-(5-氟-4-甲基-苯并咪唑-1-基)-3,3-二甲基-异喹啉+TX、3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-1-异喹啉基)-7,8-二氢-6H-环戊二烯并[e]苯并咪唑+TX(这些化合物可以由WO 2016/156085中描述的方法制备);N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]环丙烷甲酰胺+TX、N,2-二甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙酰胺+TX、N-乙基-2-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙酰胺+TX、1-甲氧基-3-甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脲+TX、1,3-二甲氧基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脲+TX、3-乙基-1-甲氧基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脲+TX、N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙酰胺+

TX、4,4-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]异噁唑烷-3-酮+TX、5,5-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]异噁唑烷-3-酮+TX、1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡唑-4-甲酸乙酯+TX、N,N-二甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]-1,2,4-三唑-3-胺+TX。这个段落中的化合物可以由WO 2017/055473、WO 2017/055469、WO 2017/093348和WO 2017/118689中描述的方法制备;2-[6-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇+TX(这种化合物可以由WO 2017/029179中描述的方法制备);2-[6-(4-溴苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇+TX(这种化合物可以由WO 2017/029179中描述的方法制备);3-[2-(1-氯环丙基)-3-(2-氟苯基)-2-羟基-丙基]咪唑-4-甲腈+TX(这种化合物可以由WO2016/156290中描述的方法制备);3-[2-(1-氯环丙基)-3-(3-氯-2-氟-苯基)-2-羟基-丙基]咪唑-4-甲腈+TX(这种化合物可以由WO 2016/156290中描述的方法制备);2-氨基-6-甲基-吡啶-3-甲酸(4-苯氧基苯基)甲酯+TX(这种化合物可以由WO 2014/006945中描述的方法制备);2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二噻英并[2,3-c:5,6-c']联吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮+TX(这种化合物可以由WO 2011/138281中描述的方法制备);N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]硫代苯甲酰胺+TX;N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺+TX;(Z,2E)-5-[1-(2,4-二氯苯基)吡唑-3-基]氧基-2-甲氧基亚氨基-N,3-二甲基-戊-3-烯胺+TX(这种化合物可以由WO 2018/153707中描述的方法制备);N'-(2-氯-5-甲基-4-苯氧基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX;N'-[2-氯-4-(2-氟苯氧基)-5-甲基-苯基]-N-乙基-N-甲基-甲脒+TX(这种化合物可以由WO 2016/202742中描述的方法制备);2-(二氟甲基)-N-[(3S)-3-乙基-1,1-二甲基-茚满-4-基]吡啶-3-甲酰胺+TX(这种化合物可以由WO 2014/095675中描述的方法制备);(5-甲基-2-吡啶基)-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲酮+TX、(3-甲基异噁唑-5-基)-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲酮+TX(这些化合物可以由WO 2017/220485中描述的方法制备);2-氧代-N-丙基-2-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙酰胺+TX(这种化合物可以由WO 2018/065414中描述的方法制备);1-[[5-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]-2-噻吩基]甲基]吡唑-4-甲酸乙酯+TX(这种化合物可以由WO 2018/158365中描述的方法制备);2,2-二氟-N-甲基-2-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙酰胺+TX、N-[(E)-甲氧基亚氨基甲基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺+TX、N-[(Z)-甲氧基亚氨基甲基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺+TX、N-[N-甲氧基-C-甲基-碳酰亚胺基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲酰胺+TX(这些化合物可以由WO 2018/202428中描述的方法制备);

[0860] 微生物,这些微生物包括:鲁氏不动杆菌+TX、枝顶孢属真菌+TX+TX、顶头孢霉菌+TX+TX、柿支顶孢菌(Acremonium diospyri)+TX、赫红枝顶孢霉(Acremonium obclavatum)+TX、棉褐带卷蛾颗粒体病毒(AdoxGV)(**Capex®**)+TX、放射形土壤杆菌菌株K84(**Galltrol-A®**)+TX、链格孢菌+TX、决明链格孢+TX、损毁链格孢(Alternaria destruens)(**Smolder®**)+TX、白粉寄生孢(**AQ10®**)+TX、黄曲霉AF36(**AF36®**)+TX、黄曲霉NRRL 21882(**Aflaguard®**)+TX、曲霉属物种+TX、出芽短梗霉菌+TX、固氮螺菌

属+TX、(**MicroAZ®**+TX、TAZO**B®**)+TX、固氮菌+TX、褐球固氮菌(Azotobacter chroococcum)(**Azotomeal®**)+TX、固氮菌囊孢(Bionatural Blooming**Blossoms®**)+TX、解淀粉芽孢杆菌+TX、蜡样芽胞杆菌+TX、蚀几丁质芽孢杆菌菌株(Bacillus chitinosporus strain)CM-1+TX、蚀几丁质芽孢杆菌菌株AQ746+TX、地衣芽孢杆菌菌株HB-2(Biostart™**Rhizoboost®**)+TX、地衣芽孢杆菌菌株3086(**EcoGuard®**+TX、Green **Releaf®**)+TX、环状芽孢杆菌+TX、坚强芽孢杆菌(**BioSafe®**+TX、**BioNem-WP®**+TX、**VOTiVO®**)+TX、坚强芽孢杆菌菌株I-1582+TX、浸麻芽孢杆菌+TX、死海芽孢杆菌+TX、巨大芽孢杆菌+TX、蕈状芽孢杆菌菌株AQ726+TX、乳突芽孢杆菌(Milky Spore **Powder®**)+TX、短小芽孢杆菌属物种+TX、短小芽孢杆菌菌株GB34(Yield**Shield®**)+TX、短小芽孢杆菌菌株AQ717+TX、短小芽孢杆菌菌株QST 2808(**Sonata®**+TX、Ballad **Plus®**)+TX、球形芽孢杆菌(Bacillus spahericus)(**VectoLex®**)+TX、芽孢杆菌属物种+TX、芽孢杆菌属菌株AQ175+TX、芽孢杆菌属菌株AQ177+TX、芽孢杆菌属菌株AQ178+TX、枯草芽孢杆菌菌株QST 713(**CEASE®**+TX、**Serenade®**+TX、**Rhapsody®**)+TX、枯草芽孢杆菌菌株QST 714(**JAZZ®**)+TX、枯草芽孢杆菌菌株AQ153+TX、枯草芽孢杆菌菌株AQ743+TX、枯草芽孢杆菌菌株QST3002+TX、枯草芽孢杆菌菌株QST3004+TX、解淀粉枯草芽孢杆菌变种菌株FZB24(**Taegro®**+TX、**Rhizopro®**)+TX、苏云金芽孢杆菌Cry 2Ae+TX、苏云金芽孢杆菌Cry1Ab+TX、苏云金芽孢杆菌鲇泽(Bacillus thuringiensis aizawai)GC 91(**Agree®**)+TX、苏云金芽孢杆菌以色列(Bacillus thuringiensis israelensis)(**BMP123®**+TX、**Aquabac®**+TX、**VectoBac®**)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克(Bacillus thuringiensis kurstaki)(**Javelin®**+TX、**Deliver®**+TX、**CryMax®**+TX、**Bonide®**+TX、Scutella**WP®**+TX、Turilav**WP ®**+TX、**Astuto®**+TX、Dipel**WP®**+TX、**Biobit®**+TX、**Foray®**)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克BMP 123(**Baritone®**)+TX、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克HD-1(Bioprotec-**CAF/3P®**)+TX、苏云金芽孢杆菌菌株BD#32+TX、苏云金芽孢杆菌菌株AQ52+TX、苏云金芽孢杆菌鲇泽变种(Bacillus thuringiensis var.aizawai)(**XenTari®**+TX、**DiPel®**)+TX、细菌属物种(**GROWMEND®**+TX、**GROWSWEET®**+TX、**Shootup®**)+TX、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、白僵菌属物种+TX、灰葡萄孢菌+TX、大豆慢生型根瘤菌(**TerraMax®**)+TX、短短小芽孢杆菌+TX、苏云金芽孢杆菌拟步行甲(**Novodor®**)+TX、BtBooster+TX、洋葱伯克霍尔德菌(**Deny®**

+TX、Intercept®+TX、BlueCircle®)+TX、伯克霍尔德菌+TX、唐菖蒲伯克霍尔德菌+TX、伯克霍尔德菌属物种+TX、加拿大蓟真菌(CBH CanadianBioherbicide®)+TX、乳酪假丝酵母+TX、无名假丝酵母+TX、果假丝酵母(Candida fructus)+TX、光滑念珠菌+TX、吉利蒙念珠菌+TX、口津假丝酵母+TX、橄榄假丝酵母菌株O+TX、近平滑假丝酵母+TX、菌膜假丝酵母+TX、铁红假丝酵母+TX、瑞氏假丝酵母+TX、齐藤假丝酵母(Bio-Coat®+TX、Biocure®)+TX、清酒假丝酵母+TX、假丝酵母属物种+TX、纤细假丝酵母+TX、戴氏西地西菌+TX、产黄纤维单胞菌+TX、螺卷毛壳(Nova-Cide®)+TX、球毛壳菌(Nova-Cide®)+TX、铁杉紫色杆菌菌株PRAA4-1T(Grandevo®)+TX、枝状枝孢菌+TX、尖孢枝孢+TX、绿头枝孢+TX、枝孢属物种+TX、极细枝孢霉+TX、粉红粘帚霉(EndoFine®)+TX、尖孢炭疽菌+TX、盾壳霉(Cotans WG®)+TX、盾壳霉属物种+TX、浅白隐球酵母(YIELDPLUS®)+TX、土生隐球菌+TX、隐球酵母属infirmo-miniatus+TX、罗伦隐球酵母+TX、苹果异形小卷蛾颗粒体病毒(Cryptex®)+TX、肯彭贪铜菌(Cupriavidus campinensis)+TX、苹果蠹蛾颗粒体病毒(CYD-X®)+TX、苹果蠹蛾颗粒体病毒(Madex®+TX、Madex Plus®+TX、Madex Max/Carpovirusine®)+TX光柱担菌(Cylindrobasidium laeve)(Stumpout®)+TX、枝双孢霉属+TX、汉逊德巴利酵母+TX、夏威夷德氏霉(Drechslera hawaiinensis)+TX、阴沟肠杆菌+TX、肠杆菌科+TX、毒力虫霉(Vektor®)+TX、附球菌+TX、黑附球菌+TX、附球孢属物种+TX、Filobasidium floriforme+TX、锐顶镰孢菌+TX、厚孢镰刀菌+TX、尖孢镰刀菌(Fusaclean®/Biofox C®)+TX、层出镰刀菌+TX、镰刀菌属物种+TX、白地霉+TX、链孢粘帚霉(Primastop®+TX、Prestop®)+TX、粉红粘帚霉+TX、粘帚霉属物种(SoilGard®)+TX、绿粘帚霉(Soilgard®)+TX、颗粒体病毒(Granupom®)+TX、嗜盐盐芽孢杆菌+TX、岸喜盐芽孢杆菌+TX、特氏盐芽孢杆菌+TX、盐单胞菌属物种+TX、冰下盐单胞菌+TX、多变盐弧菌+TX、葡萄汁有孢汉逊酵母+TX、棉铃虫核型多角体病毒(Helicovex®)+TX、谷实夜蛾核型多角体病毒(Gemstar®)+TX、异黄酮-芒柄花黄素(Myconate®)+TX、柠檬克勒克酵母+TX、克勒克酵母属物种+TX、大链壶菌(Laginex®)+TX、长孢蜡蚧菌(Vertiblast®)+TX、蝇蚧疥霉(Vertikil®)+TX、舞毒蛾核型多角体病毒(Disparvirus®)+TX、嗜盐海球菌+TX、格氏梅拉菌+TX、绿僵菌(Met52®)+TX、绿僵菌(Destruxin WP®)+TX、Metschnikowia fruticola(Shemer®)+TX、美极梅奇酵母+TX、Microdochium dimerum(Antibot®)+TX、天蓝色小单孢菌+TX、Microsphaeropsis ochracea+TX、恶臭白色真菌620(Muscudor®)+TX、Muscodor roseus菌株A3-5+TX、菌根属物种(AMykor®+TX、Root Maximizer®)+TX、疣孢漆斑菌菌株AARC-0255(DiTera®)+TX、BROS PLUS®+TX、Ophiostoma piliferum菌株D97(Sylvanex®)+TX、粉质拟青霉+TX、玫烟色拟青霉(PFR-97®+TX,

PreFeRal®)+TX、淡紫拟青霉(Biostat WP®)+TX、淡紫拟青霉菌株251(MeloCon WG®)+TX、多粘类芽孢杆菌+TX、成团泛菌(BlightBan C9-1®)+TX、泛菌属物种+TX、巴斯德氏芽菌属物种(Econem®)+TX、拟斯扎瓦巴氏杆菌+TX、黄灰青霉+TX、拜赖青霉(Jumpstart®+TX、TagTeam®)+TX、短密青霉+TX、常现青霉+TX、灰黄青霉+TX、产紫青霉+TX、青霉菌属物种+TX、纯绿色肯霉+TX、大伏革菌(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、季也蒙毕赤氏酵母(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、荧光假单胞菌菌株(Pseudomonas fluorescens strain)A506(BlightBan A506®)+TX、恶臭假单胞菌(Pseudomonas putida)+TX、Pseudomonas reactans+TX、假单胞菌属物种(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(Zequanox®)+TX、Pseudozyma flocculosa菌株PF-A22 UL(Sporodex L®)+TX、纵沟柄锈菌(Puccinia canaliculata)+TX、Puccinia thlaspeos(Wood Warrior®)+TX、Pythium paroecandrum+TX、侧雄腐霉菌(Pythium oligandrum)(Polygandron®+TX、Polyversum®)+TX、缠器腐霉(Pythium periplocum)+TX、水生拉恩菌(Rhanella aquatilis)+TX、拉恩菌属物种(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、红酵母属物种(Rhodotorula spp.)+TX、粘红酵母(Rhodotorula glutinis)+TX、禾本红酵母(Rhodotorula graminis)+TX、胶红酵母(Rhodotorula mucilagnosa)+TX、深红酵母(Rhodotorula rubra)+TX、酿酒酵母(Saccharomyces cerevisiae)+TX、玫瑰色盐水球菌(Salinococcus roseus)+TX、小核盘菌(Sclerotinia minor)+TX、小核盘菌(SARRITOR®)+TX、柱顶孢霉属(Scytalidium spp.)+TX、Scytalidium uredinicola+TX、甜菜夜蛾核型多角体病毒(Spod-X®+TX、Spexit®)+TX、粘质沙雷氏菌(Serratia marcescens)+TX、普城沙雷菌(Serratia plymuthica)+TX、沙雷氏菌属物种(Serratia spp.)+TX、粪生粪壳菌(Sordaria fimicola)+TX、海灰翅夜蛾核型多角体病毒(Spodoptera littoralis nucleopolyhedrovirus)(Littovir®)+TX、红掷孢酵母(Sporobolomyces roseus)+TX、嗜麦芽寡养单胞菌(Stenotrophomonas maltophilia)+TX、不吸水链霉菌

(Streptomyces ahygroscopicus)+TX、白丘链霉菌(Streptomyces albaduncus)+TX、脱叶链霉菌(Streptomyces exfoliates)+TX、鲜黄链霉菌(Streptomyces galbus)+TX、灰平链霉菌(Streptomyces griseoplanus)+TX、灰绿链霉菌(Streptomyces griseoviridis)(Mycostop®)+TX、利迪链霉菌(Streptomyces lydicus)(Actinovate®)+TX、利迪链霉菌WYEC-108(ActinoGrow®)+TX、紫色链霉菌(Streptomyces violaceus)+TX、小铁艾酵母(Tilletiopsis minor)+TX、铁艾酵母属物种(Tilletiopsis spp.)+TX、棘孢木霉(Trichoderma asperellum)(T34Biocontrol®)+TX、盖姆斯木霉(Trichoderma gamsii)(Tenet®)+TX、深绿木霉(Trichoderma atroviride)(Plantmate®)+TX、钩状木霉(Trichoderma hamatum)TH 382+TX、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T-39(Trichodex®)+TX、非钩木霉(Trichoderma inhamatum)+TX、康宁木霉(Trichoderma koningii)+TX、木霉属物种(Trichoderma spp.)LC 52(Sentinel®)+TX、木素木霉(Trichoderma lignorum)+TX、长柄木霉(Trichoderma longibrachiatum)+TX、多孢木霉(Trichoderma polysporum)(BinabT®)+TX、紫杉木霉(Trichoderma taxi)+TX、绿木霉(Trichoderma virens)+TX、绿木霉(原来称为绿色粘帚霉GL-21)(SoilGuard®)+TX、绿色木霉+TX、绿色木霉菌株ICC 080(Remedier®)+TX、茁芽丝孢酵母(Trichosporon pullulans)+TX、毛孢子菌属物种(Trichosporon spp.)+TX、单端孢属物种(Trichothecium spp.)+TX、粉红单端孢(Trichothecium roseum)+TX、Typhula phacorrhiza菌株94670+TX、Typhula phacorrhiza菌株94671+TX、黑细基格孢(Ulocladium atrum)+TX、奥德曼细基格孢(Ulocladium oudemansii)(Botry-Zen®)+TX、玉蜀黍黑粉菌(Ustilago maydis)+TX、各种细菌和补充营养素(NaturalII®)+TX、各种真菌(MillenniumMicrobes®)+TX、厚垣轮枝孢菌(Verticillium chlamydosporium)+TX、蜡蚧轮枝菌(Verticillium lecanii)(Mycotal®+TX、Vertalec®)+TX、Vip3Aa20(VIPtera®)+TX、死海枝芽孢杆菌(Virgibaclillus marismortui)+TX、野油菜黄单胞菌(Xanthomonas campestrispv.Poae(Camperico®)+TX、伯氏致病杆菌+TX、嗜线虫致病杆菌;

[0861] 植物提取物,这些植物提取物包括:松树油(Retenol®)+TX、印楝素(Plasma NeemOil®+TX、AzaGuard®+TX、MeemAzal®+TX、Molt-X®+TX)、植物IGR(Neemazad®+TX、Neemix®)+TX、芥花油(Lilly MillerVegol®)+TX、土荆芥(Chenopodium ambrosioides near ambrosioides)(Requiem®)+TX、菊花提取物(Crisant®)+TX、印楝油提取物(Trilogy®)+TX、唇形科(Labiatae)精油(Botania®)+TX、丁香-迷迭香-胡椒薄荷和百里香油提取物(Garden insectkiller®)+TX、甜菜碱(Greenstim®)+TX、大蒜+TX、柠檬草油(GreenMatch®)+TX、印楝油+

TX、猫薄荷(Nepeta cataria)(猫薄荷油)+TX、Nepeta catarina+TX、烟碱+TX、牛至油(MossBuster®)+TX、胡麻科(Pedaliaceae)油(Nematon®)+TX、除虫菊+TX、皂皮树(Quillaja saponaria)(NemaQ®)+TX、大虎杖(Reynoutria sachalinensis)(Regalia®+TX、Sakalia®)+TX、鱼藤酮(Eco Roten®)+TX、芸香科(Rutaceae)植物提取物(Soleo®)+TX、大豆油(Ortho ecosense®)+TX、茶树油(Timorex Gold®)+TX、百里香油+TX、AGNIQUE® MMF+TX、BugOil®+TX、迷迭香-芝麻-胡椒薄荷-百里香和肉桂提取物混合物(EF 300®)+TX、丁香-迷迭香和胡椒薄荷提取物混合物(EF 400®)+TX、丁香-胡椒薄荷-大蒜油和薄荷混合物(Soil Shot®)+TX、高岭土(Screen®)+TX、褐藻的贮存葡聚糖(Laminarin®)；

[0862] 信息素,这些信息素包括:黑头萤火虫信息素(3M Sprayable Blackheaded Fireworm Pheromone®)+TX、苹果蠹蛾信息素(Paramount dispenser-(CM)/Isomate C-Plus®)+TX、葡萄小卷叶蛾信息素(3M MEC-GBM Sprayable Pheromone®)+TX、卷叶虫信息素(3M MEC-LR Sprayable Pheromone®)+TX、家蝇信息素(Muscamone)(Snip7 Fly Bait®+TX、Starbar Premium Fly Bait®)+TX、梨小食心虫信息素(3M oriental fruit moth sprayable pheromone®)+TX、桃透翅蛾(Peachtree Borer)信息素(Isomate-P®)+TX、番茄蛀虫(Tomato Pinworm)信息素(3M Sprayable pheromone®)+TX、衣透斯特粉末(Entostat powder)(来自棕榈树的提取物)(Exosex CM®)+TX、(3E,8Z,11Z)-3,8,11-十四碳三烯乙酸酯+TX、(7Z,11Z,13E)-7,11,13-十六三烯醛+TX、(E,Z)-7,9-十二碳二烯-1-基乙酸酯+TX、2-甲基-1-丁醇+TX、乙酸钙+TX、Scenturion®+TX、Biolure®+TX、Check-Mate®+TX、薰衣草千里酸酯(Lavandulyl senecioate)+TX;

[0863] 宏生物剂(Macrobial),这些宏生物剂包括:短距蚜小蜂+TX、阿尔蚜茧蜂(Aphelinus-System®)+TX、Acerophagus papaya+TX、二星瓢虫(Adalia-System®)+TX、二星瓢虫(Adaline®)+TX、二星瓢虫(Aphidalia®)+TX、串茧跳小蜂+TX、巢蛾多胚跳小蜂+TX、安德森钝绥螨(Anderline®+TX、Andersoni-System®)+TX、加州钝绥螨(Amblyline®+TX、Spical®)+TX、黄瓜钝绥螨(Thripex®+TX、Bugline cucumeris®)+TX、伪钝绥螨(Fallacis®)+TX、斯氏钝绥螨(Bugline swirskii®+TX、Swirskii-Mite®)+TX、奥氏钝绥螨(WomerMite®)+TX、粉虱细蜂+TX、原樱翅缨小蜂+TX、暗腹长索跳小蜂+TX、卡玛长索跳小蜂+TX、Anagyrus loecki+TX、粉蚧长索跳小蜂(Citripar®)+TX、红蜡蚧扁角跳小蜂+TX、金小蜂+TX、林地花蝽(Anthocoris-System®)+TX、短距蚜小蜂(Apheline®+TX、Aphiline®)+TX、短翅蚜小蜂+TX、棉蚜寄生蜂(Aphipar®)+TX、阿尔蚜茧蜂(Ervipar®)+TX、烟蚜茧蜂+TX、桃赤蚜蚜茧蜂(Aphipar-M®)+TX、食蚜瘿蚊(Aphidend®)+TX、食蚜瘿蚊(Aphidoline®)+TX、岭

南黄蚜小蜂+TX、印巴黄蚜小蜂+TX、哈氏长尾啮小蜂+TX、蚁形隐翅甲(**Staphyline®**)+TX、熊蜂属物种+TX、欧洲熊蜂(Natupol **Beehive®**)+TX、欧洲熊蜂(**Beeline®**+TX、**Tripol®**)+TX、Cephalonomia stephanoderis+TX、黑背唇瓢虫+TX、普通草蛉(**Chrysoline®**)+TX、普通草蛉(**Chrysopa®**)+TX、红通草蛉+TX、Cirrospilus ingenuus+TX、四带瑟姬小蜂+TX、白星橘啮小蜂+TX、Closterocerus chamaeleon+TX、Closterocerus物种+TX、Coccidoxenoides perminutus(**Planopar®**)+TX、泊蚜小蜂+TX、赖食蚧蚜小蜂+TX、螟黄足盘绒茧蜂+TX、菜蛾绒茧蜂+TX、孟氏隐唇瓢虫(**Cryptobug®**+TX、**Cryptoline®**)+TX、日本方头甲+TX、西伯利亚离颚茧蜂+TX、西伯利亚离颚茧蜂(**Minusa®**)+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂(**Diminex®**)+TX、小黑瓢虫(**Delphastus®**)+TX、Delphastus pusillus+TX、Diachasmimorpha krausii+TX、长尾潜蝇茧蜂+TX、Diaparsis jucunda+TX、阿里食虱跳小蜂+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂+TX、豌豆潜叶蝇姬小蜂(**Miglyphus®**+TX、**Digline®**)+TX、西伯利亚离颚茧蜂(**DacDigline®**+TX、**Minex®**)+TX、歧脉跳小蜂属物种+TX、盾蚧长缨蚜小蜂+TX、丽蚜小蜂(Encarsia **max®**+TX、**Encarline®**+TX、**En-Strip®**)+TX、浆角蚜小蜂(**Enermix®**)+TX、哥德恩蚜小蜂+TX、海地恩蚜小蜂+TX、细扁食蚜蝇(**Syrphidend®**)+TX、Eretmoceris siphonini+TX、加州浆角蚜小蜂+TX、浆角蚜小蜂(**Ercal®**+TX、Eretline**e®**)+TX、浆角蚜小蜂(**Bemimix®**)+TX、海氏桨角蚜小蜂+TX、蒙氏桨角蚜小蜂(**Bemipar®**+TX、Eretline**m®**)+TX、Eretmocerus siphonini+TX、四斑光缘瓢虫+TX、食螨瘿蚊(**Spidend®**)+TX、食螨瘿蚊(**Feltiline®**)+TX、阿里山潜蝇茧蜂+TX、Fopius ceratitivorus+TX、芒柄花黄素(Wirless **Beehome®**)+TX、细腰凶蓟马(**Vespop®**)+TX、西方静走螨+TX、莱氏棱角肿腿蜂+TX、麦蛾柔茧蜂+TX、异色瓢虫(**HarmoBeetle®**)+TX、异小杆线虫属物种(Lawn **Patrol®**)+TX、嗜菌异小杆线虫(NemaShield **HB®**+TX、**Nemaseek®**+TX、Terranem-**Nam®**+TX、**Terranem®**+TX、**Larvanem®**+TX、**B-Green®**+TX、**NemAttack ®**+TX、**Nematop®**)+TX、大异小杆线虫(Nemasys **H®**+TX、BioNem **H®**+TX、Exhibitline**hm®**+TX、**Larvanem-M®**)+TX、斑长足瓢虫+TX、尖狭下盾螨(Aculeifer-**System®**+TX、**Entomite-A®**)+TX、兵下盾螨(Hypoline**m®**+TX、Entomite-**M®**)+TX、黑色枝跗瘿蜂+TX、Lecanoideus floccissimus+TX、Lemophagus errabundus+TX、三色丽突跳小蜂+TX、橘粉介壳虫寄生蜂(**Leptopar®**)+TX、长角跳小蜂+TX、Lindorus lophanthae+TX、Lipolexis oregmae+TX、叉叶绿蝇(**Natufly®**)+TX、茶足柄瘤蚜茧蜂+TX、盲蝽(Mirical-**N®**+TX、Macroline**c®**+TX、**Mirical®**)+TX、Mesoseiulus longipes+TX、黄色阔柄跳小蜂+TX、Metaphycus lounsburyi+TX、角纹脉褐蛉

(Milacewing®)+TX、黄色花翅跳小蜂+TX、Muscidifurax raptorellus和Spalangia cameroni(Biopar®)+TX、Neodryinus typhlocybae+TX、加州新小绥螨+TX、黄瓜新小绥螨(THRYPEX®)+TX、伪新小绥螨+TX、Nesideocoris tenuis(NesidioBug®+TX、Nesibug®)+TX、古铜黑蝇(Biofly®)+TX、狡小花蝽(Thripor-I®+TX、Oriline i®)+TX、无毛小花蝽(Thripor-L®+TX、Oriline l®)+TX、大臀小花蝽(Oriline m®)+TX、小黑花椿象(Thripor-S®)+TX、Pauesia juniperorum+TX、瓢虫柄腹姬小蜂+TX、Phasmarhabditis hermaphrodita(Nemaslug®)+TX、Phymastichus coffea+TX、粗毛小植绥螨+TX、智利小植绥螨(Spidex®+TX、Phytoline p®)+TX、斑腹刺益蝽(Podisus®)+TX、寄生性蚤蝇(Pseudacteon)curvatus+TX、寄生性蚤蝇(Pseudacteon)obtusus+TX、寄生性蚤蝇(Pseudacteon)tricuspis+TX、Pseudaphycus maculipennis+TX、Pseudleptomastix mexicana+TX、具毛嗜木虱跳小蜂+TX、同色短背茧蜂(Psyttalia concolor)(复合体)+TX、胯姬小蜂属物种+TX、Rhyzobius lophanthae+TX、澳洲瓢虫+TX、Rumina decollate+TX、Semielacher petiolatus+TX、麦长管蚜(Ervibank®)+TX、小卷蛾斯氏线虫(Nematac C®+TX、Millenium®+TX、BioNem C®+TX、NemAttack®+TX、Nemastar®+TX、Capsanem®)+TX、夜蛾斯氏线虫(NemaShield®+TX、Nemasys F®+TX、BioNem F®+TX、Steinernema-System®+TX、NemAttack®+TX、Nemaplus®+TX、Exhibitline sf®+TX、Scia-rid®+TX、Entonem®)+TX、锯蜂线虫(Nemasys L®+TX、BioNem L®+TX、Exhibitline srb®)+TX、锐比斯氏线虫(BioVector®+TX、BioVektor®)+TX、蝼蛄斯氏线虫(Nematac S®)+TX、斯氏线虫属物种+TX、斯氏科物种(Guardian Nematodes®)+TX、深点食螨瓢虫(Stethorus®)+TX、亮腹釉小蜂+TX、Tetrastichus setifer+TX、Thripobius semiluteus+TX、中华长尾小蜂+TX、甘蓝夜蛾赤眼蜂(Tricholine b®)+TX、甘蓝夜蛾赤眼蜂(Tricho-Strip®)+TX、广赤眼蜂+TX、微小赤眼蜂+TX、玉米螟赤眼蜂+TX、宽脉赤眼蜂+TX、短管赤眼蜂+TX、螟黑点瘤姬蜂+TX;

[0864] 其他生物制剂,这些其他生物制剂包括:脱落酸+TX、bioSea®+TX、银叶菌(Chondrostereum purpureum)(Chontrol Paste®)+TX、盘长孢状刺盘孢(Collego®)+TX、辛酸铜(Cueva®)+TX、δ捕捉物(Delta trap)(Trapline d®)+TX、解淀粉欧文氏菌(Harpin)(ProAct®+TX、Ni-HIBIT GoldCST®)+TX、衍生自特级初榨橄榄油的天然副产物的脂肪酸(FLIPPER®)+TX、磷酸高铁(Ferramol®)+TX、漏斗捕捉物(Funnel trap)(Trapline y®)+TX、Gallex®+TX、Grower's Secret®+TX、高油菜素内酯(Homo-brassonolide)+TX、磷酸铁(Lilly Miller Worry Free Ferramol Slug&Snail Bait®)+TX、MCP冰雹捕捉物(hail trap)(Trapline f®)+TX、寄生性昆虫南美食甲茧蜂

(Microctonus hyperodae)+TX、Mycoleptodiscus terrestris(**Des-X®**)+TX、**BioGain®**+TX、**Aminomite®**+TX、**Zenox®**+TX、信息素罗网(Thripline**ams®**)+TX、碳酸氢钾(**MilStop®**)+TX、脂肪酸的钾盐(**Sanova®**)+TX、硅酸钾溶液(**Sil-Matrix®**)+TX、碘化钾+硫氰酸钾(**Enzicur®**)+TX、**SuffOil-X®**+TX、蜘蛛毒+TX、蝗虫微孢子虫(Semaspore Organic Grasshopper **Control®**)+TX、粘捕捉物(Trapline **YF®**+TX、Rebell **Amarillo®**)+TX以及捕捉物(Takitrapline y+**b®**)+TX;

[0865] (1)选自以下的组的抗细菌剂:

[0866] (1.1)细菌,其实例为摩加夫芽孢杆菌(Bacillus mojavensis)菌株R3B(登记号NCAIM(P)B001389)(WO 2013/034938),来自三井物产株式会社(Mitsui&Co.)的子公司瑟缇丝美国公司(Certis USA LLC)+TX;短小芽孢杆菌,特别是菌株BU F-33,具有NRRL登记号50185(可作为**CARTISSA®**产品的部分从巴斯夫公司(BASF)获得,EPA登记号71840-19)+TX;枯草芽孢杆菌,特别是菌株QST713/AQ713(可作为来自美国的拜耳作物科学公司(Bayer CropScience LP)的SERENADE OPTI或SERENADE ASO获得,具有NRRL登记号B21661,美国专利号6,060,051)+TX;枯草芽孢杆菌菌株BU1814,(可作为**VELONDIS®** PLUS、**VELONDIS®** FLEX和**VELONDIS®** EXTRA从巴斯夫公司(BASF SE)获得)+TX;枯草芽孢杆菌变种解淀粉菌株FZB24,具有登记号DSM 10271(可作为**TAEGRO®**或**TAEGRO®** ECO(EPA登记号70127-5)从诺维信公司(Novozymes)获得)+TX;枯草芽孢杆菌CX-9060,来自三井物产株式会社的子公司瑟缇丝美国公司+TX;芽孢杆菌属物种,特别是菌株D747(可作为DOUBLE **NICKEL®**从组合化学工业株式会社(Kumiai Chemical Industry Co.,Ltd.)获得),具有登记号FERM BP-8234,美国专利号7,094,592+TX;类芽孢杆菌属物种菌株,具有登记号NRRL B-50972或登记号NRRL B-67129,WO 2016/154297+TX;多粘类芽孢杆菌,特别是菌株AC-1(例如,来自绿色生物技术有限公司(Green Biotech Company Ltd.)的**TOPSEED®**)+TX;成团泛菌,特别是菌株E325(登记号NRRL B-21856)(可作为BLOOMTIME BIOLOGICAL™ FD BIOPESTICIDE从西北农产品公司(Northwest Agri Products)获得)+TX;普罗拉迪克斯假单胞菌(Pseudomonas proradix)(例如,来自索控帕德纳公司(Sourcon Padena)的**PRORADIX®**)+TX;以及

[0867] (1.2)真菌,其实例为出芽短梗霉菌,特别是菌株DSM14940的芽生孢子、菌株DSM14941的芽生孢子或菌株DSM14940和DSM14941的芽生孢子的混合物(例如,来自瑞士的百奥-菲牧公司(bio-ferm)的**BOTECTOR®**和BLOSSOM**PROTECT®**)+TX;蚜虫拟酵母菌(Pseudozyma aphidis)(如耶路撒冷希伯来大学伊森姆研究发展有限公司(Yissum Research Development Company of the Hebrew University of Jerusalem)在WO 2011/151819中所披露的)+TX;酿酒酵母(Saccharomyces cerevisiae),特别是菌株CNCM号1-3936、CNCM号1-3937、CNCM号1-3938或CNCM号1-3939(如WO 2010/086790中披露的,来自法国的乐斯福公司(Lesaffre et Compagnie))+TX;

[0868] (2)选自以下的组的生物杀真菌剂:

[0869] (2.1)细菌,其实例为放射形土壤杆菌菌株K84(例如来自加利福尼亚州的艾格生

物化学公司(AgBioChem)的GALLTROL-A®)+TX;放射形土壤杆菌菌株K1026(例如来自巴斯夫公司的NOGALL™)+TX;枯草芽孢杆菌变种解淀粉菌株FZB24,具有登记号DSM 10271(可作为TAEGRO®或TAEGRO®ECO(EPA登记号70127-5)从诺维信公司(Novozymes)获得)+TX;解淀粉芽孢杆菌,特别是菌株D747(可作为Double Nickel™从组合化学工业株式会社获得,具有登记号FERM BP-8234,美国专利号7,094,592)+TX;解淀粉芽孢杆菌菌株F727(也称为菌株MBI110)(NRRL登记号B-50768,WO 2014/028521)(来自马罗尼生物创新公司(Marrone Bio Innovations)的STARGUS®)+TX;解淀粉芽孢杆菌菌株FZB42,登记号DSM 23117,(可作为RHIZOVITAL®从德国的艾比泰普公司(ABiTEP)获得)+TX;解淀粉芽孢杆菌分离物B246(例如,来自比勒陀利亚大学(University of Pretoria)的AVOGREEN™)+TX;地衣芽孢杆菌,特别是菌株SB3086,具有登记号ATCC 55406,WO 2003/000051(可作为ECOGUARD®生物杀真菌剂和GREEN RELEAF™从诺维信公司和获得)+TX+TX;地衣芽孢杆菌FMCH001和枯草芽孢杆菌FMCH002(来自FMC公司的QUARTZO®(WG)和PRESENCE®(WP))+TX;甲基营养型芽孢杆菌(Bacillus甲基otrophicus)菌株BAC-9912(来自中国科学院应用生态研究所)+TX;摩加夫芽孢杆菌(Bacillus mojavensis)菌株R3B(登记号NCAIM(P)B001389)(WO 2013/034938),来自三井物产株式会社的子公司瑟缇丝美国公司+TX;蕈状芽孢杆菌分离物,具有登记号B-30890(可作为BMJTGAI®或WG和LifeGard™从三井物产株式会社的子公司瑟缇丝美国公司的获得)+TX;短小芽孢杆菌,特别是菌株QST2808(可作为SONATA®从美国的拜耳作物科学公司获得,具有登记号NRRL B-30087并且描述于美国专利号6,245,551中)+TX;短小芽孢杆菌,特别是菌株GB34(可作为YieldShield®从德国的拜耳公司(Bayer AG)获得)+TX;短小芽孢杆菌,特别是菌株BU F-33,具有NRRL登记号50185(可作为CARTISSA产品的部分从巴斯夫公司获得,EPA登记号71840-19)+TX;枯草芽孢杆菌,特别是菌株QST713/AQ713(可作为SERENADE OPTI或SERENADE ASO从美国的拜耳作物科学公司(Bayer CropScience LP)获得,具有NRRL登记号B21661,并且描述于美国专利号6,060,051中)+TX;枯草芽孢杆菌Y1336(可作为BIOBAC®WP从中国台湾的百泰公司(Bion-Tech)获得,作为生物杀真菌剂在中国台湾登记在登记号4764、5454、5096和5277下)+TX;枯草芽孢杆菌菌株MBI 600(可作为SUBTILEX从巴斯夫公司获得,具有登记号NRRL B-50595,美国专利号5,061,495)+TX;枯草芽孢杆菌菌株GB03(可作为Kodiak®从德国的拜耳公司获得)+TX;枯草芽孢杆菌菌株BU1814,(可作为VELONDIS®PLUS、VELONDIS®FLEX和VELONDIS®EXTRA从巴斯夫公司获得)+TX;枯草芽孢杆菌CX-9060,来自三井物产株式会社的子公司瑟缇丝美国公司+TX;枯草芽孢杆菌KTSB菌株(来自唐纳吉公司(Donaghys)的FOLIACTIVE®)+TX;枯草芽孢杆菌IAB/BS03(来自斯托克顿生物-农业技术公司(STK Bio-Ag Technologies)的AVIV™、来自艾戴自然公司(Idai Nature)的PORTENTO®)+TX;枯草芽孢杆菌菌株Y1336(可作为BIOBAC®WP从中国台湾的百泰公司获得,作为生物杀真菌剂在中国台湾登记在登记号4764、5454、5096和5277下)+TX;附生类芽孢杆菌(Paenibacillus epiphyticus)(WO 2016/020371),来自巴斯夫公司+TX;多粘类芽孢杆菌植物属物种(WO 2016/020371),来自巴斯夫公司+TX;类芽孢杆菌属物种菌株,具有登记号

NRRL B-50972或登记号NRRL B-67129,WO 2016/154297+TX;绿针假单胞菌菌株AFS009,具有登记号NRRL B-50897,WO 2017/019448(例如,来自美国的农业生物群落创新公司(AgBiome Innovations)的HOWLER™和ZIO®)+TX;绿针假单胞菌菌株,特别是菌株MA342(例如,来自百圭公司(Bioagri)和科伯特(Koppert)公司的CEDOMON®、CERALL®、和CEDRESS®)+TX;荧光假单胞菌菌株A506(例如,来自新农公司(NuFarm)的BLIGHTBAN® A506)+TX;普罗拉迪克斯假单胞菌(Pseudomonas proradix)(例如,来自索控帕德纳公司的PRORADIX®)+TX;灰绿链霉菌(Streptomyces griseoviridis)菌株K61(也称为鲜黄链霉菌菌株K61)(登记号DSM 7206)(来自瓦德拉公司(Verdera)的MYCOSTOP®、来自拜沃公司(BioWorks)的PREFENCE®,参见作物保护2006,25,468-475)+TX;利迪链霉菌(Streptomyces lydicus)菌株WYEC108(也称为利迪链霉菌(Streptomyces lydicus)菌株WYCD108US)(来自诺维信公司的ACTINO-IRON®和ACTINOVATE®)+TX;以及

[0870] (2.2)真菌,其实例为白粉寄生孢,特别是菌株AQ 10(例如,来自因特拉化学生物意大利公司(IntrachemBio Italia)的AQ10®)+TX;白粉寄生孢菌株AQ10,具有登记号CNCM 1-807(例如,来自因特拉化学生物意大利公司的AQ10®)+TX;黄曲霉菌株NRRL 21882(作为来自先正达公司(Syngenta)/中国化工公司(ChemChina)的AFLA-GUARD®而已知的产品)+TX;出芽短梗霉菌,特别是菌株DSM14940的芽生孢子+TX;出芽短梗霉菌,特别是菌株DSM 14941的芽生孢子+TX;出芽短梗霉菌,特别是菌株DSM14940和DSM 14941的芽生孢子的混合物(例如,来自瑞士的百奥-菲牧公司的Botector®)+TX;角毛壳菌(Chaetomium cupreum)(登记号CABI 353812)(例如,来自农业生活公司(AgriLife)的BIOKUPRUM™)+TX;球毛壳菌(Chaetomium globosum)(可作为RIVADIOM®由莱威尔公司(Rivale)获得)+TX;枝状枝孢菌(Cladosporiumcladosporioides),菌株H39,具有登记号CBS122244,US2010/0291039(由瓦赫宁根研究基金会(Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoek))+TX;盾壳霉(Coniothyrium minitans),特别是菌株CON/M/91-8(登记号DSM9660,例如,来自拜耳作物科学生物公司(Bayer CropScience Biologics GmbH)的Contans ®)+TX;微黄隐球菌(Cryptococcus flavescens),菌株3C(NRRL Y-50378),(B2.2.99)+TX;白秃指状霉(Dactylaria candida)+TX;迪洛弗丝芙拉阿洛配库里(Dilophosphora alopecuri)(可作为TWIST FUNGUS®获得)+TX;尖孢镰刀菌,菌株Fo47(可作为FUSACLEAN®由自然植物保护公司(Natural Plant Protection)获得)+TX;链孢粘帚霉(Gliocladium catenulatum)(同义词:链状粉红螺旋聚孢霉(Clonostachys rosea f.catenulate))菌株J1446(例如,来自拉曼公司(Lallemand)的Prestop ®)+TX;粉红粘帚霉(Gliocladium roseum)(也称为粉红粘帚霉(Clonostachys rosea)),特别是来自辅加公司(Adjuvants Plus)的菌株321U、如Xue(Efficacy of Clonostachys rosea strain ACM941 and fungicide seed treatments for controlling the root tot complex of field pea[粉红粘帚霉菌株ACM941和杀真菌剂种子处理对控制豌豆根腐病复合体的功效],Can Jour

Plant Sci[加拿大植物学报]83(3):519-524)中所披露的菌株ACM941、或菌株IK726(Jensen DF等人Development of a biocontrol agent for plant disease control with special emphasis on the near commercial fungal antagonist Clonostachys rosea strain'IK726'[特别强调近商业的真菌拮抗剂粉红粘帚霉菌株'IK726'的用于植物病害控制的生物控制剂的开发],Australas Plant Pathol.[澳大利亚植物病理学]2007,36:95-101)+TX;蜡蚧轮枝菌(Lecanicillium lecanii)(原称为蜡蚧轮枝菌(Verticillium lecanii))菌株KV01的分生孢子(例如,来自科伯特公司/爱利思达公司(Arysta)的**Vertalec®**)+TX;果生美极梅奇酵母(Metschnikowia fructicola),特别是菌株NRRL Y-30752,(B2.2.3)+TX;赭色小球壳孢菌(Microsphaeropsis ochracea)+TX;恶臭玫红真菌(Muscodor roseus),特别是菌株A3-5(登记号NRRL 30548)+TX;歧皱青霉(Penicillium steckii)(DSM 27859,WO 2015/067800)来自巴斯夫公司+TX;蠕形青霉(Penicillium vermiculatum)+TX;大伏革菌(Phlebiopsis gigantean)菌株VRA 1992(来自丹斯塔发酵公司(Danstar Ferment)的**ROTSTOP®**C)+TX;异常毕赤酵母,菌株WRL-076(NRRL Y-30842),美国专利号7,579,183+TX;絮状假酵母菌(Pseudozyma flocculosa),菌株PF-A22 UL(可作为**SPORODEX®**L从加利福尼亚州的植物产品公司(Plant ProductsCo.)获得)+TX;酿酒酵母(Saccharomyces cerevisiae),特别是菌株LAS02(来自农业酵母及其衍生物公司(Agro-Levures et Dérivés)),菌株LAS117细胞壁(来自乐斯福公司的**CEREVISANE®**、来自巴斯夫公司的**ROMEO®**),来自法国的乐斯福公司的菌株CNCM号1-3936、CNCM号1-3937、CNCM号1-3938、CNCM号1-3939(WO 2010/086790)+TX;新普利斯利姆拉诺桑尼弗(Simplicillium lanosoniveum)+TX;黄色篮状菌(Talaromyces flavus),菌株V117b+TX;粗枝木霉(Trichoderma asperelloides)JM41R(登记号NRRL B-50759)(来自巴斯夫公司的TRICHO**PLUS®**)+TX;棘孢木霉(Trichoderma asperellum),特别是菌株kd(例如,来自安德玛特生物控制公司(Andermatt Biocontrol)的T-Gro)+TX;棘孢木霉(Trichoderma asperellum),特别是菌株SKT-1,具有登记号FERM P-16510(例如,来自组合化学工业株式会社的**ECO-HOPE®**)、菌株T34(例如,来自西班牙的生物控制技术公司(Biocontrol Technologies S.L.)的T34)或来自意赛格公司(Isagro)的菌株ICC 012+TX;深绿木霉(Trichoderma atroviride),特别是菌株SC1(具有登记号CBS122089,WO 2009/116106和美国专利号8,431,120(来自农业生物制品公司(Bi-PA)))、菌株77B(来自安德玛特生物控制公司的T77)或菌株LU132(例如,来自阿格里牧技术有限公司(Agrimm Technologies Limited)的Sentinel)+TX;深绿木霉,菌株CNCM 1-1237(例如,来自法国的阿格劳可辛公司(Agrauxine)的**Esquive®**WP)+TX;深绿木霉,菌株号V08/002387+TX;深绿木霉,菌株NMI号V08/002388+TX;深绿木霉,菌株NMI号V08/002389+TX;深绿木霉,菌株NMI号V08/002390+TX;深绿木霉,菌株LC52(例如,来自阿格里牧技术有限公司的Tenet)+TX;深绿木霉,菌株ATCC 20476(IMI 206040)+TX;深绿木霉,菌株T11(IMI352941/CECT20498)+TX;深绿木霉,菌株SKT-1(FERM P-16510),日本专利公布(小海公司)11-253151A+TX;深绿木霉,菌株SKT-2(FERM P-16511),日本专利公布(小海公司)11-253151A+TX;深绿木霉,菌株SKT-3(FERM P-17021),日本专利公布(小海公司)11-253151A+TX;顶孢木霉(Trichoderma fertile)(例如,来自巴斯夫公司的产品TrichoPlus)+TX;盖姆斯木霉

(Trichoderma gamsii)(原绿色木霉),菌株ICC080(IMI CC 392151CABI,例如,来自阿格里拜尔索墨西哥公司(AGROBIOSOL DE MEXICO,S.A.DE C.V.)的BioDerma)+TX;盖姆斯木霉(Trichoderma gamsii)(原绿色木霉),菌株ICC 080(IMI CC 392151CABI)(可作为**BIODERMA®**从阿格里拜尔索墨西哥公司获得)+TX;钩状木霉(Trichoderma harmatum)+TX;钩状木霉,具有登记号ATCC 28012+TX;哈茨木霉(Trichoderma harzianum)菌株T-22(例如,来自安德玛特生物控制公司或科伯特公司的Trianum-P)或菌株Cepa SimbT5(来自辛伯斯农业公司(Simbiose Agro))+TX;哈茨木霉+TX;哈茨木霉斜面(rifai)T39(例如来自美国的马克特信阿甘公司(Makhteshim)的**Trichodex®**)+TX;哈茨木霉,菌株ITEM 908(例如,来自科伯特公司的Trianum-P)+TX;哈茨木霉,菌株TH35(例如,来自麦康特尔公司(Mycontrol)的Root-Pro)+TX;哈茨木霉,菌株DB 103(可作为**T-GRO®** 7456从达古塔特生物实验室(Dagutat Biolab)获得)+TX;多孢木霉(Trichoderma polysporum),菌株IMI 206039(例如,来自瑞典的BINAB生物创新公司(BINAB Bio-Innovation AB)的Binab TF WP)+TX;子座木霉(Trichoderma stromaticum),具有登记号Ts3550(例如,来自巴西的可可种植计划执行委员会(CEPLAC)的Tricovab)+TX;绿木霉(Trichoderma virens)(也称为绿粘帚霉(Gliocladium virens)),特别是菌株GL-21(例如,来自美国的瑟缇丝(Certis)公司的SoilGard)+TX;绿木霉菌株G-41,原称为绿粘帚霉(Gliocladium virens)(登记号ATCC 20906)(例如,来自美国的拜沃公司的**ROOTSHIELD®** PLUS WP和**TURFSHIELD®** PLUS WP)+TX;绿色木霉(Trichoderma viride),菌株TV1(例如,来自科伯特公司的Trianum-P)+TX;绿色木霉,特别是菌株B35(Pietr等人,1993,Zesz.Nauk.A R w Szczecinie[什切青农业大学科学卷]161:125-137)+TX;棘孢木霉(Trichoderma asperellum)菌株ICC 012(也称为哈茨木霉ICC012)(具有登记号CABI CC IMI 392716)和盖姆斯木霉(Trichoderma gamsii)(原绿色木霉)菌株ICC 080(具有登记号IMI 392151)的混合物(例如来自意赛格美国公司的BIO-TAM™和来自阿格里拜尔索墨西哥公司的**BIODERMA®**)+TX;奥德曼细基格孢(Ulocladium oudemansii)菌株U3,具有登记号NM 99/06216(例如,来自新西兰的宝特锐曾公司(Botry-Zen Ltd)的**BOTRY-ZEN®**和来自拜沃公司的**BOTRYSTOP®**)+TX;白-黑轮枝菌(Verticillium albo-atrum)(原大丽轮枝菌(V.dahliae)),菌株WCS850,具有登记号WCS850,保藏在真菌培养中心局(Central Bureau for Fungi Cultures)(例如,由树木护理创新公司(Tree Care Innovations)的DUTCH **TRIG®**)+TX;厚垣轮枝孢菌(Verticilliumchlamydosporium)+TX;

[0871] (3)选自以下的组的具有改善植物生长和/或植物健康效果的生物控制剂:

[0872] (3.1)细菌,其实例为巴西固氮螺菌(Azospirillum brasilense)(例如,来自可鲁公司(KALO,Inc.)的**VIGOR®**)+TX;生脂固氮螺菌(Azospirillum lipoferum)(例如,来自特拉麦克斯公司(TerraMax,Inc.)的VERTEX-IF™)+TX;茎瘤固氮根瘤菌(Azorhizobiumcaulinodans),特别是菌株ZB-SK-5+TX;圆褐固氮菌(Azotobacter chroococcum),特别是菌株H23+TX;棕色固氮菌(Azotobacter vinelandii),特别是菌株ATCC 12837+TX;棕色固氮菌(Azotobacter vinelandii)和巴氏芽孢梭菌(Clostridium pasteurianum)的混合物(可作为**INVIGORATE®**从阿坤纳斯公司(Agrinos)获得)+

TX;解淀粉芽孢杆菌pm414(来自生物膜作物保护公司(Biofilm Crop Protection)的**LOLI-PEPTA®**)+TX;解淀粉芽孢杆菌SB3281(ATCC#PTA-7542,WO 2017/205258)+TX;解淀粉芽孢杆菌TJ1000(可作为**QUIKROOTS®**从诺维信公司获得)+TX;解淀粉芽孢杆菌,特别是菌株IN937a+TX;解淀粉芽孢杆菌,特别是菌株FZB42(例如,来自德国的艾比泰普公司的**RHIZOVITAL®**)+TX;解淀粉芽孢杆菌BS27(登记号NRRL B-5015)+TX;蜡样芽孢杆菌科成员EE128(NRRL号B-50917)+TX;蜡样芽孢杆菌科成员EE349(NRRL号B-50928)+TX;蜡样芽孢杆菌,特别是菌株BP01(ATCC 55675,例如,来自美国的爱利思达生命科学公司(Arysta Lifescience)的**MEPICHLOR®**)+TX;坚强芽孢杆菌,特别是菌株CNMC 1-1582(例如,来自巴斯夫公司的**VOTIVO®**)+TX;蕈状芽孢杆菌BT155(NRRL号B-50921)+TX;蕈状芽孢杆菌EE118(NRRL号B-50918)+TX;蕈状芽孢杆菌EE141(NRRL号B-50916)+TX;蕈状芽孢杆菌BT46-3(NRRL号B-50922)+TX;短小芽孢杆菌,特别是菌株QST2808(具有登记号NRRL号B-30087)+TX;短小芽孢杆菌,特别是菌株GB34(例如,来自德国的拜耳作物科学公司的YIELD**SHIELD®**)+TX;暹罗芽孢杆菌(Bacillus siamensis),特别是菌株KCTC 13613T+TX;枯草芽孢杆菌,特别是菌株QST713/AQ713(具有NRRL登记号B-21661并且描述于美国专利号6,060,051中,可作为**SERENADE®**OPTI或**SERENADE®**ASO从美国的拜耳作物科学公司获得)+TX;枯草芽孢杆菌,特别是菌株AQ30002(具有登记号NRRL B-50421并且描述于美国专利申请号13/330,576中)+TX;枯草芽孢杆菌,特别是菌株AQ30004(以及NRRL B-50455并且描述于美国专利申请号13/330,576中)+TX;枯草芽孢杆菌菌株BU1814(可作为**TEQUALIS®**从巴斯夫公司获得)、枯草芽孢杆菌rm303(来自生物膜作物保护公司的**RHIZOMAX®**)+TX;苏云金芽孢杆菌BT013A(NRRL号B-50924),也称为苏云金芽孢杆菌4Q7+TX;地衣芽孢杆菌FMCH001和枯草芽孢杆菌FMCH002的混合物(可作为**QUARTZO®** (WG)、**PRESENCE®** (WP)从FMC公司获得)+TX;枯草芽孢杆菌,特别是菌株MBI 600(例如,来自巴斯夫公司的**SUBTILEX®**)+TX;特基拉芽孢杆菌(Bacillus tequilensis),特别是菌株NII-0943+TX;大豆慢生型根瘤菌(Bradyrhizobium japonicum)(例如,来自诺维信公司的**OPTIMIZE®**)+TX;食酸戴尔福特菌(Delftia acidovorans),特别是菌株RAY209(例如,来自布雷特氧种子公司(Brett Young Seeds)的**BIOBOOST®**)+TX;鹰嘴豆中间根瘤菌(Mesorhizobium cicer)(例如,来自巴斯夫公司的NODULATOR)+TX;乳杆菌属物种(例如,来自拉特帕菲公司(LactoPAFI)的**LACTOPLANT®**)+TX;豆科根瘤菌(Rhizobium leguminosarium biovar viciae)(例如,来自巴斯夫公司的NODULATOR)+TX;普罗拉迪克斯假单胞菌(Pseudomonas proradix)(例如,来自索控帕德纳公司的**PRORADIX®**)+TX;铜绿假单胞菌,特别是菌株PN1+TX;豆科根瘤菌(Rhizobium leguminosarum),特别是蚕豆根瘤菌(bv.viceae)菌株Z25(登记号CECT 4585)+TX;多粘类芽孢杆菌,特别是菌株AC-1(例如,来自绿色生物技术有限公司的**TOPSEED®**)+TX;粘质沙雷氏菌(Serratia marcescens),特别是菌株SRM(登记号MTCC 8708)+TX;苜蓿中华根瘤菌(Sinorhizobium meliloti)菌株NRG-185-1(来自拜耳作物科学公司的**NITRAGIN®**GOLD)+TX;硫杆状菌属物种(Thiobacillus sp.)

(例如,来自英国的克劳普埃德公司(Cropaid Ltd)的**CROPAID®**)+TX;以及

[0873] (3.2)真菌,其实例为淡紫字胞菌(Purpureocillium lilacinum)(曾称为淡紫拟青霉(Paecilomyces lilacinus))菌株251(AGAL 89/030550,例如,来自拜耳作物科学生物公司的BioAct)+TX;拜赖青霉(Penicillium bilaii),菌株ATCC 22348(例如,来自阿克塞尔隆生物农业公司(Acceleron BioAg)的**JumpStart®**)、黄色篮状菌(Talaromyces flavu),菌株V117b+TX;深绿木霉菌株CNCM 1-1237(例如,来自法国的阿格劳可辛公司的**Esquive®**WP)、绿色木霉,例如菌株B35(Pietr等人,1993,Zesz.Nauk.A R w Szczecinie[什切青农业大学科学卷]161:125-137)+TX;深绿木霉菌株LC52(也称为深绿木霉菌株LU132,例如,来自阿格里牧技术有限公司的Sentinel)+TX;深绿木霉菌株SC1(描述于国际申请号PCT/IT2008/000196中)+TX;棘孢木霉(Trichoderma asperellum)菌株kd(例如,来自安德玛特生物控制公司的T-Gro)+TX;棘孢木霉(Trichoderma asperellum)菌株Eco-T(新西兰的植物健康产品公司)、哈茨木霉菌株T-22(例如,来自安德玛特生物控制公司或科伯特公司的Trianum-P)+TX;疣孢漆斑菌菌株AARC-0255(例如,来自华仑生物科学公司(Valent Biosciences)的DiTera™)+TX;拜赖青霉(Penicillium bilaii)菌株ATCC ATCC20851+TX;侧雄腐霉菌(Pythium oligandrum)菌株M1(ATCC 38472,例如,来自捷克的拜奥普雷普罗迪公司(Bioprepraty)的Polyversum)+TX;绿木霉菌株GL-21(例如,来自美国的瑟缇丝公司的**SoilGard®**)+TX;白-黑轮枝菌(Verticillium albo-atrum)(原大丽轮枝菌(V.dahliae))菌株WCS850(CBS276.92,例如,来自树木护理创新公司的Dutch Trig)+TX;深绿木霉,特别是菌株号V08/002387、菌株号NMI号V08/002388、菌株号NMI号V08/002389、菌株号NMI号V08/002390+TX;哈茨木霉菌株ITEM 908、哈茨木霉菌株TSTh20+TX;哈茨木霉菌株1295-22+TX;侧雄腐霉菌(Pythium oligandrum)菌株DV74+TX;阿米尔氏须腹菌(Rhizopogon amylopogon)(例如,包含在来自海伦娜化学公司(Helena Chemical Company)的Myco-Sol中)+TX;富尔维氏须腹菌(Rhizopogon fulvigleba)(例如,包含在来自海伦娜化学公司的Myco-Sol中)+TX;绿木霉菌株GI-3+TX;

[0874] (4)选自以下的杀昆虫活性生物控制剂

[0875] (4.1)细菌,其实例为放射形土壤杆菌菌株K84(来自艾格生物化学公司的Galltrol)+TX;解淀粉芽孢杆菌,特别是菌株PTS-4838(例如,来自美国的华仑生物科学公司的AVEO)+TX;坚强芽孢杆菌,特别是菌株CNMC 1-1582(例如,来自巴斯夫公司的**VOTIVO®**)+TX;蕈状芽孢杆菌分离物J.(例如,来自三井物产株式会社的子公司瑟缇丝美国公司的BmJ)+TX;球形芽孢杆菌(Bacillus sphaericus),特别是血清型H5a5b菌株2362(菌株ABTS-1743)(例如,来自美国的华仑生物科学公司的**VECTOLEX®**)+TX;苏云金芽孢杆菌鲇泽亚种(subsp.aizawai),特别是菌株ABTS-1857(SD-1372,例如,来自华仑生物科学公司的**XENTARI®**)+TX;苏云金芽孢杆菌鲇泽亚种(subsp.aizawai),特别是血清型H-7(例如,来自美国的华仑生物科学公司的**FLORBAC®**WG)+TX;苏云金芽孢杆菌以色列(Bacillus thuringiensis israelensis)菌株BMP 144(例如,来自伊利诺伊州的贝克尔微生物产品公司(Becker Microbial Products)的**AQUABAC®**)+TX;苏云金芽孢杆菌以色列亚种(subsp.israelensis)(血清型H-14)菌株AM65-52(登记号ATCC 1276)

(例如,来自美国的华仑生物科学公司的**VECTOBAC®**)+TX;苏云金芽孢杆菌鲇泽亚种(subsp.aizawai)菌株GC-91+TX;苏云金芽孢杆菌科尔默变种(var.Colmeri)(例如,来自常州市江海化工公司(Changzhou Jianghai Chemical Factory)的TIANBAOBTC)+TX;苏云金芽孢杆菌日本变种菌株Buibui+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种菌株BMP 123,来自伊利诺伊州的贝克尔微生物产品公司+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种菌株BMP 123(来自伊利诺伊州的贝克尔微生物产品公司),例如,来自拜耳作物科学公司的BARITONE+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种菌株HD-1(例如,来自美国的华仑生物科学公司的**DIPEL®**ES)+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克变种菌株EVB-113-19(例如,来自AEF全球公司(AEF Global)的**BIOPROTEC®**)+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种菌株ABTS 351+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种菌株PB 54+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种菌株SA 11,(来自美国的瑟缇丝公司的JAVELIN)+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种菌株SA 12(来自美国的瑟缇丝公司的THURICIDE)+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种菌株EG 2348(来自美国的瑟缇丝公司的LEPINOX)+TX;苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种菌株EG 7841(来自美国的瑟缇丝公司的CRYMAX)+TX;苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种(subsp.tenebrionis)菌株NB 176(SD-5428,例如,来自德国的拜奥法公司(BioFa)的**NOVODOR®**FC)+TX;侧孢芽孢杆菌(Brevibacillus laterosporus)(来自易克利布瑞姆生物公司(Ecolibrium Biologicals)的LATERAL)+TX;伯克霍尔德菌属物种,特别是里诺肯斯伯克霍尔德菌(Burkholderia rinojensis)菌株A396(也称为里诺肯斯伯克霍尔德菌(Burkholderia rinojensis)菌株MBI 305)(登记号NRRL B-50319+TX;WO 2011/106491和WO 2013/032693+TX;例如,来自马罗尼生物创新公司的MBI206 TGAI和**ZELTO®**)+TX;铁杉紫色杆菌(Chromobacterium subtsugae),特别是菌株PRAA4-1T(MBI-203+TX;例如,来自马罗尼生物创新公司的**GRANDEVO®**)+TX;蝇蚧疥霉(Lecanicillium muscarium)Ve6(来自科伯特公司的MYCOTAL)+TX;日本金龟子类芽孢杆菌(Paenibacillus popilliae)(原日本金龟子芽孢杆菌(Bacillus popilliae)+TX;例如来自圣加布里埃尔实验室(St.Gabriel Laboratories)的MILKY SPORE POWDER™和MILKY SPORE GRANULAR™)+TX;拟斯扎瓦巴氏杆菌菌株Pn1(来自先正达公司/中国化工公司的CLARIVA)+TX;嗜虫沙雷氏菌(Serratia entomophila)(例如,莱特森种子公司(Wrightson Seeds)的**INVADE®**)+TX;粘质沙雷氏菌(Serratia marcescens),特别是菌株SRM(登记号MTCC 8708)+TX;棘孢木霉(Trichoderma asperellum)(来自诺维信公司的TRICHODERMAX)+TX;毕梯斯沃巴契亚体(Wolbachia pipientis)ZAP菌株(例如,来自莫斯克托梅特公司(MosquitoMate)的ZAP**MALES®**)+TX;以及

[0876] (4.2)真菌,其实例为球孢白僵菌(Beauveria bassiana)菌株ATCC 74040(例如,来自因特拉化学生物意大利公司的**NATURALIS®**)+TX;球孢白僵菌(Beauveria bassiana)菌株GHA(登记号ATCC74250,例如,来自拉弗莱姆国际公司(Laverlam International Corporation)的**BOTANIGUARD®**ES和**MYCONTROL-O®**)+TX;球孢白僵菌(Beauveria bassiana)菌株ATP02(登记号DSM 24665)+TX;玫烟色棒束孢(Isaria fumosorosea)(先前称为玫烟色拟青霉(Paecilomyces fumosoroseus)菌株

Apopka 97)(来自SePRO的PREFERAL)+TX;绿僵菌3213-1(保藏在NRRL登记号67074下)(WO 2017/066094+TX;先锋良种国际公司(Pioneer Hi-Bred Internationa))+TX;罗伯茨绿僵菌15013-1(保藏在NRRL登记号67073下)+TX;罗伯茨绿僵菌23013-3(保藏在NRRL登记号67075下)+TX;淡紫色拟青霉菌株251(来自美国的瑟缇丝公司的MELOCON)+TX;拉迪肯虫瘟霉(Zoophtora radicans)+TX;

[0877] (5)选自由以下组成的组的病毒:棉褐带卷蛾(苹果小卷蛾(summer fruit tortrix))颗粒体病毒(GV)+TX;苹果蠹蛾(Cydia pomonella/codling moth)颗粒体病毒(GV)+TX;棉铃虫(Helicoverpa armigera/cotton bollworm)核型多角体病毒(NPV)+TX;甜菜夜蛾(Spodoptera exigua/beet armyworm)mNPV+TX;草地贪夜蛾(秋夜蛾)mNPV+TX;海灰翅夜蛾(非洲棉叶蛾)NPV+TX;

[0878] (6)可以被作为“接种剂”添加至植物或植物部分或植物器官、并且由于其特定特性而促进植物生长和植物健康的选自以下的细菌和真菌:土壤杆菌属物种(Agrobacterium spp.)+TX;茎瘤固氮根瘤菌(Azorhizobium caulinodans)+TX;固氮螺菌属物种+TX;固氮菌属物种+TX;慢生型根瘤菌属物种+TX;伯克霍尔德菌属物种(Burkholderia spp.),特别是洋葱伯克霍尔德菌(Burkholderia cepacia)(原称为洋葱假单胞菌)+TX;巨孢囊霉属物种或单孢巨孢囊霉(Gigaspora monosporum)+TX;球囊霉属物种(Glomus spp.)+TX;蜡蘑属物种(Laccaria spp.)+TX;布氏乳杆菌(LactoBacillus buchneri)+TX;类球囊霉属物种(Paraglomus spp.)+TX;采色豆马勃(Pisolithus tinctorus)+TX;假单胞菌属物种+TX;根瘤菌属物种,特别是三叶草根瘤菌(Rhizobium trifolii)+TX;须腹菌属物种(Rhizopogon spp.)+TX;硬皮马勃属物种(Scleroderma spp.)+TX;乳牛肝菌属物种(Suillus spp.)+TX;链霉菌属物种+TX;

[0879] (7)可用作生物控制剂的植物提取物和由微生物形成的产物(包括蛋白质和次生代谢物),其选自大蒜(Allium sativum)(来自艾科斯普瑞公司(Eco-Spray)的NEMGUARD+TX;来自安道麦公司(ADAMA)的BRALIC)+TX;Armour-Zen+TX;苦艾(Artemisia absinthium)+TX;印楝素(例如,来自美国的瑟缇丝公司的AZATIN XL)+TX;Biokeeper WP+TX;十字花科(Brassicaceae)提取物,特别是油菜粉或芥茉粉+TX;黑决明子(Cassia nigricans)+TX;苦皮藤(Celastrus angulatus)+TX;美洲土荆芥(Chenopodium anthelminticum)+TX;几丁质(Chitin)+TX;欧洲鳞毛蕨(Dryopteris filix-mas)+TX;问荆(Equisetum arvense)+TX;Fortune Aza+TX;Fungastop+TX;Heads Up(藜麦皂苷(Chenopodium quinoa saponin)提取物)+TX;PROBLAD(来自羽扇豆种子的天然存在的Blad多肽),瑟缇丝欧洲公司+TX;FRACTURE(来自羽扇豆种子的天然存在的Blad多肽),FMC公司+TX;除虫菊(Pyrethrum)/除虫菊酯(Pyrethrins)+TX;苏里南苦木(Quassia amara)+TX;栎(Quercus)+TX;皂树(Quillaja)提取物(来自巴斯夫公司的QL AGRI 35)+TX;大虎杖提取物(来自马罗尼生物公司(Marrone Bio)的REGALLIA/REGALIA MAXX)+TX;“Requiem™杀昆虫剂”+TX;鱼藤酮+TX;鱼尼丁(ryania)/兰尼碱(ryanodine)+TX;聚合草(Symphytum officinale)+TX;菊蒿+TX;百里酚(Thymol)+TX;与香叶醇(Geraniol)混合的百里酚(Thymol)(来自伊甸研究公司(Eden Research)的CEDROZ)+TX;与香叶醇(Geraniol)和丁子香酚(Eugenol)混合的百里酚(Thymol)(来自伊甸研究公司的MEVALONE)+TX;Triact 70+TX;TriCon+TX;旱金莲(Tropaeulum majus)+TX;互叶白千层提取物(Melaleuca alternifolia)(来自斯托克顿公

司(STK)的TIMOREX GOLD)+TX;大荨麻(Urtica dioica)+TX;藜芦碱(Veratrin)+TX;和白槲寄生(Viscum album)+TX;以及

[0880] 安全剂,如解草嗪+TX、解草酯(包括解毒喹)+TX、环丙磺酰胺+TX、二氯丙烯胺+TX、解草唑(包括解草唑-乙基)+TX、解草啶+TX、氟草肟+TX、解草噁唑+TX、双苯噁唑酸(包括双苯噁唑酸-乙基)+TX、吡唑解草酯(mefenpyr)(包括吡唑解草酯-二乙基)+TX、解草磺酰胺(metcamifen)+TX和解草腈+TX。

[0881] 在活性成分之后的括号中的参考例如[3878-19-1]是指化学文摘登记号。上文描述的混合配伍物是已知的。在活性成分包括在“The Pesticide Manual[杀有害生物剂手册]”[The Pesticide Manual-AWorld Compendium[杀有害生物剂手册-全球概览];第13版;编辑:C.D.S.TomLin;The British Crop Protection Council[英国农作物保护委员会]]中的情况下,它们在其中以上文对于特定化合物的圆括号中所给出的条目编号来描述;例如化合物“阿维菌素”以条目编号(1)来描述。在“[CCN]”在上文添加到特定化合物的情况下,所讨论的化合物包括在“Compendium of Pesticide Common Names[杀有害生物剂通用名纲要]”中,其可以在互联网[A.Wood;Compendium of Pesticide Common Names, Copyright © 1995-2004]上获得;例如,化合物“乙酰虫腈”描述于互联网地址http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html中。

[0882] 以上描述的活性成分中的大多数通过上文中所谓的“通用名”来表示,在不同的情形中使用相应的“ISO通用名”或另一“通用名”。若名称不是“通用名”,则所使用的名称种类以特定化合物的圆括号中所给出的名称来代替;在这种情况下,使用IUPAC名称、IUPAC/化学文摘名、“化学名称”、“传统名称”、“化合物名称”或“研究代码”,或若既不使用那些名称之一也不使用“通用名”,则使用“别名”。“CAS登记号”意指化学文摘登记号。

[0883] 选自表A-1至A-36、表B-1至B-36、表C-1至C-36和表D-1至D-36以及表P的具有式I的化合物与上述活性成分的活性成分混合物包含选自表A-1至A-36、表B-1至B-36、表C-1至C-36和表D-1至D-36以及表P的化合物和如上所述的活性成分,这些化合物和这些活性成分优选地处于从100:1至1:6000,尤其是从50:1至1:50的混合比,更尤其是处于从20:1至1:20的比率,甚至更尤其是从10:1至1:10,非常尤其是从5:1和1:5的比率,特别优选的从2:1至1:2的比率,并且同样优选的是从4:1至2:1的比率,尤其是1:1、或5:1、或5:2、或5:3、或5:4、或4:1、或4:2、或4:3、或3:1、或3:2、或2:1、或1:5、或2:5、或3:5、或4:5、或1:4、或2:4、或3:4、或1:3、或2:3、或1:2、或1:600、或1:300、或1:150、或1:35、或2:35、或4:35、或1:75、或2:75、或4:75、或1:6000、或1:3000、或1:1500、或1:350、或2:350、或4:350、或1:750、或2:750、或4:750的比率。那些混合比率是按重量计的。

[0884] 如上所述的混合物可以被用于控制有害生物的方法中,该方法包括将包含如上所述的混合物的组合物施用于有害生物或其环境中,通过手术或疗法用于处理人或动物体的方法以及在人或动物体上实施的诊断方法除外。

[0885] 包含选自表A-1至A-36、表B-1至B-36、表C-1至C-36和表D-1至D-36以及表P的具有式I的化合物和一种或多种如上所述的活性成分的混合物可以例如如下施用:以单一的“掺水即用”的形式,以组合式喷雾混合物(所述混合物由单一活性成分组分的单独配制品构成,例如“桶混剂”),以及当以顺序方式(即,一个在另一个适度短的时间段之后,如几小时或几天)施用时组合使用这些单一活性成分。施用选自表A-1至A-36、表B-1至B-36、表C-1至

C-36和表D-1至D-36以及表P的具有式I的化合物和如上文所述的活性成分的顺序对于实施本发明并不是至关重要的。

[0886] 根据本发明的组合物还可以包含另外的固体或液体助剂,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,肥料或其他用于实现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。

[0887] 根据本发明的组合物是以本身已知的方式,在不存在助剂的情况下,例如通过研磨、筛选和/或压缩固体活性成分;和在至少一种助剂的存在下,例如通过紧密混合活性成分与一种或多种助剂和/或将活性成分与一种或多种助剂一起研磨来制备。用于制备组合物的这些方法以及具有式I的化合物用于制备这些组合物的用途也是本发明的主题。

[0888] 这些组合物的施用方法,即控制上述类型的有害生物的方法,如喷雾、雾化、撒粉、刷涂、包衣、撒播或浇灌-它们被选择以适于普遍情况的预期目的-以及这些组合物用于控制上述类型的有害生物的用途是本发明的其他主题。典型的浓度比是在0.1ppm与1000ppm之间、优选在0.1ppm与500ppm之间的活性成分。每公顷的施用比率通常是每公顷1至2000g活性成分、特别是10至1000g/ha、优选地是10至600g/ha。

[0889] 在作物保护领域中,优选的施用方法是施用至这些植物的叶(叶施用),可能的是选择施用的频率和比率以符合所讨论的有害生物的侵染风险。可替代地,该活性成分可以经由根系统(内吸作用)到达植物,其通过用液体组合物将这些植物的场所浸透或通过将以固体形式的活性成分引入植物的场所中(例如引入土壤中,例如以颗粒剂的形式(土壤施用))。在水稻作物的情况下,此类颗粒剂可以被计量加入淹水的稻田中。

[0890] 本发明的化合物及其组合物还适合于植物繁殖材料(例如种子,如果实、块茎或籽粒,或者苗圃植物)的保护,以对抗上述类型的有害生物。可以用该化合物在种植前对该繁殖材料进行处理,例如可以在播种前对种子进行处理。可替代地,可以将该化合物施用至种子籽粒(包衣),其通过将籽粒浸渍入液体组合物中或通过施用固体组合物层。还可能在将该繁殖材料种植在施用场地时施用这些组合物,例如在条播期间将这些组合物施入种子犁沟。这些用于植物繁殖材料的处理方法和如此处理的植物繁殖材料是本发明的另外主题。典型的处理比率将取决于要控制的植物以及有害生物/真菌,并且通常在每100kg种子1克至200克之间、优选在每100kg种子5克至150克之间,如在每100kg种子10克至100克之间。

[0891] 术语种子包括所有种类的种子以及植物繁殖体,包括但不限于真正的种子、种子块、吸盘、谷粒、鳞球茎、果实、块茎、谷物、根茎、插条、切割枝条等并且在优选实施例中意指真正的种子。

[0892] 本发明还包括用具有式I的化合物包衣或处理的种子或含有具有式I的化合物的种子。尽管取决于施用的方法成分的更多或更少的部分可以渗透到种子材料中,术语“用……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,活性成分在种子的表面上。当(再)种植所述种子产品时,它可以吸收活性成分。在实施例中,本发明使得可获得其上粘附有具有式(I)的化合物的植物繁殖材料。此外,由此使得可获得包含用具有式(I)的化合物处理过的植物繁殖材料的组合物。

[0893] 种子处理包括本领域中已知的所有合适的种子处理技术,如拌种、种子包衣、种子撒粉、浸种以及种子造粒。可以通过任何已知的方法进行具有式(I)的化合物的种子处理施

用,如在种子播种之前或播种/种植过程中对种子喷雾或撒粉。

[0894] 生物学实例:

[0895] 接下来的实例用来说明本发明。本发明的某些化合物与已知的化合物的区别可以在于在低施用比率下更大的功效,这可以由本领域的技术人员使用在实例中概述的实验程序,使用更低的施用比率(如果必要的话)例如,50ppm、12.5ppm、6ppm、3ppm、1.5ppm、0.8ppm或0.2ppm来证实。

[0896] 实例B1:对抗二化螟(Chilo suppressalis)(水稻二化螟(Striped rice stemborer))的活性

[0897] 将具有人工饲料的24孔微量滴定板用由10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液通过移液进行处理。干燥之后,用L2期幼虫对板进行侵染(6-8只/孔)。侵染后6天,相比于未处理样品,针对死亡率、拒食效果、以及生长抑制对这些样品进行评估。当这些类别(死亡率、拒食效果和生长抑制)中的至少一个高于未处理的样品时,实现测试样品对二化螟的控制。

[0898] 以下化合物在200ppm的施用比率下产生至少80%的控制:P2、P4、P5、P7、P8、P9、P10、P11、P13、P14、P15。

[0899] 实例B2:对抗黄瓜条叶甲(Diabrotica balteata)(玉米根虫)的活性

[0900] 将24孔微量滴定板中的置于琼脂层上的玉米芽通过喷雾用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行处理。干燥之后,用L2期幼虫对板进行侵染(6至10只/孔)。侵染后4天,相比于未处理样品,针对死亡率和生长抑制对这些样品进行评估。

[0901] 以下化合物在200ppm的施用比率下给出了两个类别(死亡率或生长抑制)中至少一个的至少80%的效果:P2、P3、P4、P5、P7、P9、P10、P11、P13、P14、P15。

[0902] 实例B3:对抗英雄美洲蝽(Euschistus heros)(新热带褐臭蝽)的活性

[0903] 将24孔微量滴定板中的琼脂上的大豆叶片用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。干燥之后,用N2期若虫对叶片进行侵染。侵染后5天,相比于未处理样品,针对死亡率和生长抑制对这些样品进行评估。

[0904] 以下化合物在200ppm的施用比率下给出了两个类别(死亡率或生长抑制)中至少一个的至少80%的效果:P2、P3、P4、P5、P7、P11、P13、P14、P15。

[0905] 实例B4:对抗桃蚜(Myzus persicae)(绿色桃蚜虫)的活性,摄食/接触活性

[0906] 将向日葵叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并且用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。干燥之后,用混合年龄的蚜虫种群对叶圆片进行侵染。侵染后6天,针对死亡率对这些样品进行评估。

[0907] 以下化合物在200ppm的施用比率下产生至少80%的死亡率:P2、P3、P4、P5、P7、P10、P11、P13、P14、P15。

[0908] 实例B5:对抗桃蚜(绿桃蚜虫)的活性内吸活性

[0909] 将受到混合年龄的蚜虫种群侵染的豌豆幼苗的根部直接放在从10'000DMSO储备溶液制备的水性测试溶液中。将幼苗放置在测试溶液中6天之后,针对死亡率对这些样品进行评估。

[0910] 以下化合物在24ppm测试比率下产生至少80%的死亡率:P2、P4、P5、P7、P11、P13、P14。

[0911] 实例B6:对抗小菜蛾(Plutella xylostella)(小菜蛾(Diamond back moth))的活性

[0912] 将具有人工饲料的24孔微量滴定板用由10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液通过移液进行处理。干燥之后,将菜蛾属卵吸移穿过塑料模板到凝胶印迹纸上并且用其封闭板。侵染后8天,相比于未处理样品,针对死亡率和生长抑制对这些样品进行评估。

[0913] 以下化合物在200ppm的施用比率下给出了两个类别(死亡率或生长抑制)中至少一个的至少80%的效果:P2、P3、P4、P5、P7、P9、P10、P11、P13、P14、P15。

[0914] 实例B7:对抗海灰翅夜蛾(Spodoptera littoralis)(埃及棉叶虫)的活性

[0915] 将棉花叶圆片置于24孔微量滴定板中的琼脂上并且用从10'000ppm DMSO储备溶液制备的水性测试溶液进行喷雾。干燥之后,将叶圆片用五只L1期幼虫进行侵染。侵染后3天,相比于未处理样品,针对死亡率、拒食效果、以及生长抑制对这些样品进行评估。当这些类别(死亡率、拒食效果、和生长抑制)中的至少一个高于未处理的样品时,实现测试样品对海灰翅夜蛾的控制。

[0916] 以下化合物在200ppm的施用比率下产生至少80%的控制:P2、P3、P4、P5、P7、P8、P9、P10、P11、P13、P14、P15、P16。