201920146

(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本 (11)公開編號：TW 201920146 A

(43)公開日： 中華民國 108 (2019) 年 06 月 01 日

(21)申請案號：107123146 (22)申請日： 中華民國 107 (2018) 年 07 月 04 日

(51)Int. Cl.： *C07D403/10 (2006.01)* *C07D471/04 (2006.01)*
A01N43/52 (2006.01) *A01N43/90 (2006.01)*

(30)優先權：2017/07/05 印度 201711023665

(71)申請人：瑞士商先正達合夥公司 (瑞士) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (CH)
瑞士

(72)發明人：羅維爾 吉瑞席 RAWAL, GIRISH (IN)；裘格 皮耳 約瑟 瑪瑟爾 JUNG, PIERRE JOSEPH MARCEL (FR)；愛德門斯 安德魯 EDMUNDS, ANDREW (GB)；席克維爾 維卡司 SIKERVAR, VIKAS (IN)；山恩 印迪拉 SEN, INDIRA (IN)；韓德勒 塞巴斯蒂安 RENDLER, SEBASTIAN (DE)；慕勒巴哈 米歇爾 MUEHLEBACH, MICHEL (CH)；布賀胡茲 安格 BUCHHOLZ, ANKE (DE)；艾米瑞 丹尼爾 EMERY, DANIEL (CH)

(74)代理人：閻啟泰；林景郁

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：37 項 圖式數：0 共 209 頁

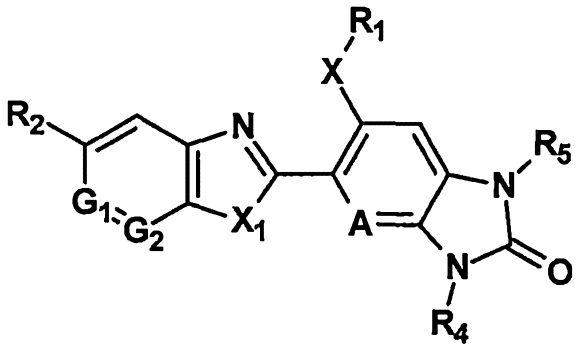
(54)名稱

具有含硫取代基之殺有害生物活性的雜環衍生物

PESTICIDALLY ACTIVE HETEROCYCLIC DERIVATIVES WITH SULFUR CONTAINING SUBSTITUENTS

(57)摘要

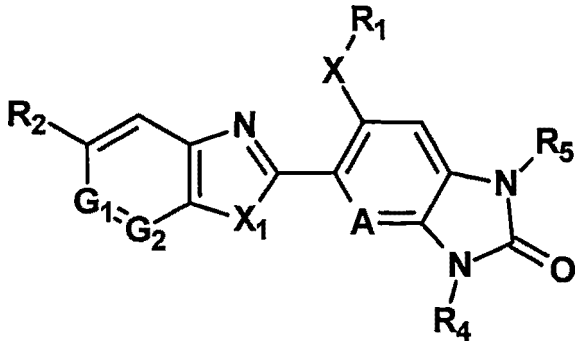
具有式 I 之化合物



(I)，

其中 R_2、G_1、G_2、X、X_1、A、R_4 和 R_5 係如在申請專利範圍第 1 項中所定義的，以及那些化合物的農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物和 N-氧化物，可以用作殺昆蟲劑並且可按照本身已知的方式製備。

Compounds of formula I



(I),

wherein the substituents are as defined in claim 1, and the agrochemically acceptable salts, stereoisomers, enantiomers, tautomers and N-oxides of those compounds, can be used as insecticides and can be prepared in a manner known per se.

【發明說明書】

【中文發明名稱】 具有含硫取代基之殺有害生物活性雜環衍生物

【英文發明名稱】 Pesticidally active heterocyclic derivatives with sulfur containing substituents

【技術領域】

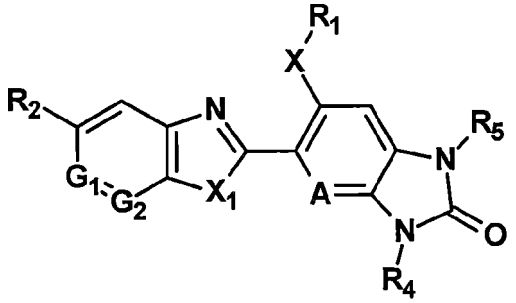
【0001】 本發明涉及含硫取代基之殺有害生物活性（特別是殺昆蟲活性）雜環衍生物，涉及用於它們的製備之方法，涉及包含那些化合物的組成物，並且涉及它們用於控制動物有害生物（包括節肢動物並且尤其是昆蟲或蜱螨目的代表）之用途。

【先前技術】

【0002】 具有殺有害生物作用且具有含硫取代基的雜環化合物係已知的並且描述於例如WO 2016/091731中。現在已經發現具有含硫取代基的新穎的殺有害生物活性衍生物，其特徵在於特定的(氮雜)苯并咪唑-2-酮部分。

【發明內容】

【0003】 因此，本發明涉及具有式I之化合物，



(I)，

其中

A表示CH或N；

X係S、SO或SO_2；

X_1係O、S或NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基；

R_1係C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵代烷基或C_3-C_6環烷基C_1-C_4烷基；

R_2係鹵素、C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基、C_1-C_4鹵代烷基磺醯基或C_1-C_6鹵代烷氧基；

G_1係N或CH；

G_2係N或CH；並且

R_4和R_5彼此獨立地是氫、C_1-C_6烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6炔基、C_3-C_6環烷基C_1-C_4烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6鹵代烯基、C_3-C_6鹵代環烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_6鹵代烷氧基、C_1-C_4烷基磺醯基、C_3-C_6環烷基磺醯基、C_1-C_4烷基羰基、C_3-C_6環烷基羰基、C_1-C_4烷氧基羰基或氰基；以及

具有式I之化合物的農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物和N-氧化物。

【0004】 具有至少一個鹼性中心的具有式I之化合物可以與以下酸形成例如酸加成鹽，該等酸為：例如強無機酸（如礦物酸，例如過氯酸、硫酸、硝酸、亞硝酸、磷酸或氫鹵酸），強有機羧酸（如未經取代的或例如被鹵素取代的C_1-C_4烷羧酸，例如乙酸（如飽和或不飽和的二羧酸），例如草酸、丙二酸、琥珀酸、馬來酸、富馬酸或鄰苯二甲酸（如羥基羧酸），例如抗壞血酸、乳酸、蘋果酸、酒石酸或檸檬酸，或如苯甲酸），或有機磺酸（如未經取代的或例如被鹵素取代的C_1-C_4烷-或芳基磺酸，例如甲烷-或對甲苯磺酸）。具有至少一個酸性基團的具有式I之化合物可以例如與鹼形成鹽，例如礦物鹽，如鹼金屬或鹼土金屬鹽，例如鈉鹽、鉀鹽或鎂鹽；或與氨或有機胺形成鹽，如味啉、哌啶、吡咯啶、單、二或三低碳數烷基胺，例如乙胺、二乙胺、三乙胺或二甲基丙基胺，或單、二或三羥基低碳數烷基胺，例如單乙醇胺、二乙醇胺或三乙醇胺。

【0005】 在取代基定義中出現的烷基基團可以是直鏈的或支鏈的，並且是

例如甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、二級丁基、異丁基、三級丁基、戊基、己基以及它們的支鏈異構物。烷基氫硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、烷氧基、烯基和炔基基團衍生自所提及的烷基基團。烯基和炔基基團可以是單不飽和的或多不飽和的。

【0006】 鹵素通常是氟、氯、溴或碘。相應地，這也適用於與其他含義結合的鹵素，如鹵代烷基或鹵代苯基。

【0007】 鹵代烷基基團較佳的是具有從1至6個碳原子的鏈長。鹵代烷基係例如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、2,2,2-三氟乙基、2-氟乙基、2-氯乙基、五氟乙基、1,1-二氟-2,2,2-三氯乙基、2,2,3,3-四氟乙基以及2,2,2-三氯乙基；較佳的是三氯甲基、二氟氯甲基、二氟甲基、三氟甲基和二氯氟甲基。

【0008】 烷氧基基團較佳的是具有從1至6個碳原子的較佳的鏈長。烷氧基係例如甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、異丁氧基、二級丁氧基和三級丁氧基以及同分異構的戊氧基和己氧基基團；較佳的是甲氧基和乙氧基。

【0009】 烷氧基烷基基團較佳的是具有1至6個碳原子的鏈長，更較佳的是具有1至4個碳原子的鏈長。烷氧基烷基係例如甲氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基甲基、乙氧基乙基、正丙氧基甲基、正丙氧基乙基、異丙氧基甲基或異丙氧基乙基。

【0010】 烷基氫硫基係例如甲基氫硫基、乙基氫硫基、丙基氫硫基、異丙基氫硫基、丁基氫硫基、戊基氫硫基以及己基氫硫基。

【0011】 烷基亞磺醯基係例如甲基亞磺醯基、乙基亞磺醯基、丙基亞磺醯基、異丙基亞磺醯基、丁基亞磺醯基、戊基亞磺醯基以及己基亞磺醯基。

【0012】 烷基磺醯基係例如甲基磺醯基、乙基磺醯基、丙基磺醯基、異丙

基磺醯基、丁基磺醯基、戊基磺醯基以及己基磺醯基。

【0013】 環烷基基團較佳的是具有從3至6個環碳原子，例如環丙基、環丁基、環戊基和環己基。

【0014】 鹵代烷氧基基團較佳的是具有從1至4個碳原子的鏈長。鹵代烷氧基係例如二氟甲氧基、三氟甲氧基或2,2,2-三氟乙氧基。

【0015】 鹵代烷基氫硫基基團較佳的是具有從1至4個碳原子的鏈長。鹵代烷基氫硫基係例如二氟甲基氫硫基、三氟甲基氫硫基或2,2,2-三氟乙基氫硫基。類似的考慮適用於基團C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基和C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，它們可以是例如三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基或2,2,2-三氟乙基磺醯基。

【0016】 自由基表示甲基基團。

【0017】 根據本發明的具有式I之化合物還包括在鹽形成期間可以形成的水合物。

【0018】 根據本發明的具有式I之化合物還包括此類化合物的所有合適的同位素變體。本發明化合物的同位素變體被定義為其中的至少一個原子被具有相同原子序數但原子質量不同於在自然界中通常或主要發現的原子質量的原子替代的同位素變體。

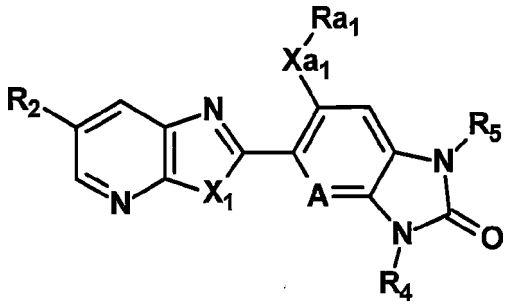
【0019】 術語“包括”（“comprising”、“comprises”和“comprise”）當在說明書中使用時包括對應的術語“由……組成”（“consisting of”、“consists of”和“consist of”）。

【0020】 在一個實施方式中，具有式I之化合物的較佳的組係其中的R_4和R_5彼此獨立地是氫、C_1-C_6烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6炔基、C_3-C_6環烷基C_1-C_4烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6鹵代烯基、C_3-C_6鹵代環烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷氧基的那些。

【0021】 在另一個實施方式中，具有式I之化合物係較佳的，其中R_4和R_5

彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6炔基、C_3-C_6環烷基C_1-C_4烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6鹵代烯基、C_3-C_6鹵代環烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_6鹵代烷氧基、C_1-C_4烷基磺醯基、C_3-C_6環烷基磺醯基、C_1-C_4烷基羰基、C_3-C_6環烷基羰基、C_1-C_4烷氧基羰基或氰基。

【0022】 具有式I之化合物的另一較佳的組由具有式I-1之化合物表示



(I-1)，

其中R_2、X_1、A、R_4和R_5係如上文在式I下所定義的；並且其中Xa_1係S、SO或SO_2；Ra_1係甲基、乙基、正丙基、異丙基或環丙基甲基。

【0023】 所述具有式I-1之化合物的較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是氫、C_1-C_6烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6炔基、C_3-C_6環烷基C_1-C_4烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6鹵代烯基、C_3-C_6鹵代環烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷氧基的化合物。

【0024】 所述具有式I-1之化合物的另一個較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6炔基、C_3-C_6環烷基C_1-C_4烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6鹵代烯基、C_3-C_6鹵代環烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_6鹵代烷氧基、C_1-C_4烷基磺醯基、C_3-C_6環烷基磺醯基、C_1-C_4烷基羰基、C_3-C_6環烷基羰基、C_1-C_4烷氧基羰基或氰基的化合物。

【0025】 在具有式I-1之化合物的較佳的組中，A較佳的是N；Xa_1較佳的是S或SO_2，更較佳的是SO_2；並且Ra_1較佳的是乙基。在具有式I-1之化合物的進

一步較佳的組中，A較佳的是CH；Xa_1較佳的是S或SO_2，更較佳的是SO_2；並且Ra_1較佳的是乙基。在具有式I-1之化合物的另一個較佳的組中，X_1較佳的是NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基，更較佳的是甲基；並且R_2較佳的是C_1-C_6鹵代烷基，更較佳的是三氟甲基。

【0026】 在上文提及的具有式I-1之化合物和具有式I-1之化合物的所有較佳的實施方式中，除非另有說明，R_4和R_5係如上文在式I下所定義的。所述具有式I-1之化合物的進一步較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是氫或C_1-C_6烷基，甚至更較佳的是氫、甲基或乙基的化合物。

【0027】 在進一步較佳的實施方式中，所述具有式I-1之化合物包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基，甚至更較佳的是甲基或乙基的那些。

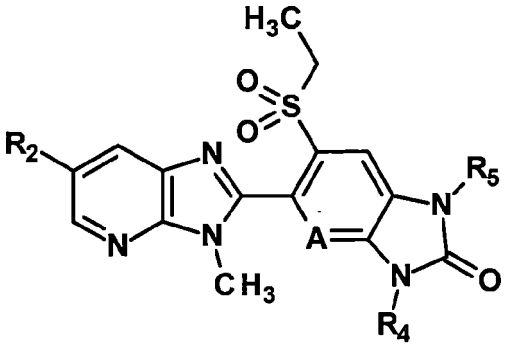
【0028】 所述具有式I-1之化合物的另一個較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基的化合物。

【0029】 所述具有式I-1之化合物的又另一個較佳的實施方式包括如下化合物，其中

R_5係C_1-C_6烷基，甚至更較佳的是甲基或乙基；並且

R_4係C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【0030】 具有式I之化合物的另一個較佳的組由具有式I-2之化合物表示



(I-2)，

其中

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是氫或C_1-C_6烷基，較佳的是氫、甲基或乙基。

【0031】 在進一步較佳的實施方式中，所述具有式I-2之化合物包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基，較佳的是甲基或乙基的那些。

【0032】 具有式I-2之化合物的所述較佳的組的另一個較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5係甲基的化合物。

【0033】 具有式I之化合物的另一個較佳的組由具有如上文所述的式I-2之化合物表示

其中

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯

基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【0034】 在具有式I-2之化合物的進一步較佳的組中，

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【0035】 在具有式I-2之化合物的又另一個較佳的組中，

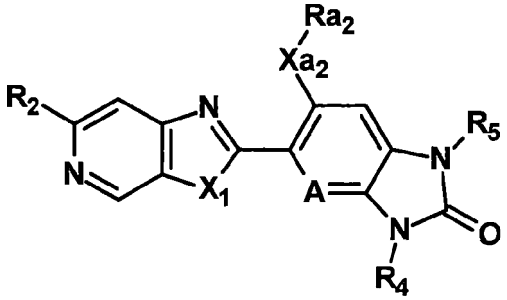
A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基；

R_5係C_1-C_6烷基，甚至更較佳的是甲基或乙基；並且

R_4係C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【0036】 具有式I之化合物的進一步較佳的組由具有式I-3之化合物表示



(I-3)，

其中R_2、X_1、A、R_4和R_5係如上文在式I下所定義的；

Xa_2係S、SO或SO_2；並且

Ra_2係甲基、乙基、正丙基、異丙基或環丙基甲基。

【0037】 所述具有式I-3之化合物的較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是氫、C_1-C_6烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6炔基、C_3-C_6環烷基C_1-C_4烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6鹵代烯基、C_3-C_6鹵代環烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷氧基的化合物。

【0038】 所述具有式I-3之化合物的另一個較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6炔基、C_3-C_6環烷基C_1-C_4烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6鹵代烯基、C_3-C_6鹵代環烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_6鹵代烷氧基、C_1-C_4烷基磺醯基、C_3-C_6環烷基磺醯基、C_1-C_4烷基羰基、C_3-C_6環烷基羰基、C_1-C_4烷氧基羰基或氰基的化合物。

【0039】 在具有式I-3之化合物的較佳的組中，A較佳的是N；Xa_2較佳的是S或SO_2，更較佳的是SO_2；並且Ra_2較佳的是乙基。在具有式I-3之化合物的進一步較佳的組中，A較佳的是CH；Xa_2較佳的是S或SO_2，更較佳的是SO_2；並且Ra_2較佳的是乙基。

【0040】 在具有式I-3之化合物的另一個較佳的組中，X_1較佳的是NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基，更較佳的是甲基；並且R_2較佳的是C_1-C_6鹵代烷基，更較佳的是三氟甲基。

【0041】 在上文提及的具有式I-3之化合物和具有式I-3之化合物的所有較佳的實施方式中，除非另有說明，R_4和R_5係如上文在式I下所定義的。所述具有式I-3之化合物的進一步較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是氫或C_1-C_6烷基，甚至更較佳的是氫、甲基或乙基的化合物。

【0042】 在進一步較佳的實施方式中，所述具有式I-3之化合物包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基，甚至更較佳的是甲基或乙基的那些。

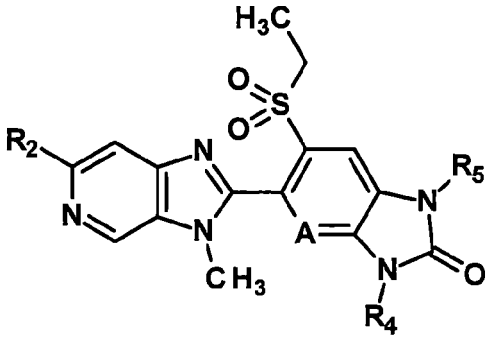
【0043】 所述具有式I-3之化合物的另一個較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基的化合物。

【0044】 所述具有式I-3之化合物的又另一個較佳的實施方式包括如下化合物，其中

R_5係C_1-C_6烷基，甚至更較佳的是甲基或乙基；並且

R_4係C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【0045】 具有式I之化合物的另一個較佳的組由具有式I-4之化合物表示



(I-4)，

其中

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是氫或C_1-C_6烷基，較佳的是氫、甲基或乙基。

【0046】 在進一步較佳的實施方式中，所述具有式I-4之化合物包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基，較佳的是甲基或乙基的那些。

【0047】 所述具有式I-4之化合物的另一個較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5係甲基的化合物。

【0048】 在具有式I-4之化合物的另一個較佳的組中，

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【0049】 在具有式I-4之化合物的進一步較佳的組中，

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【0050】 在具有式I-4之化合物的又另一個較佳的組中，

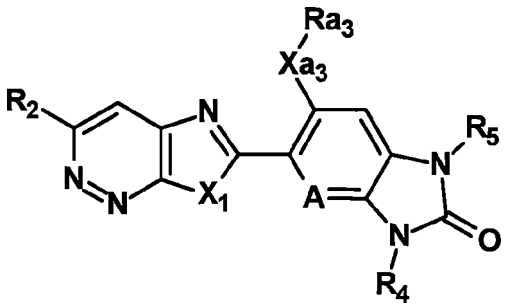
A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基；

R_5係C_1-C_6烷基，甚至更較佳的是甲基或乙基；並且

R_4係C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【0051】 具有式I之化合物的進一步較佳的組由具有式I-5之化合物表示



(I-5)，

其中R_2、X_1、A、R_4和R_5係如上文在式I下所定義的；

Xa_3係S、SO或SO_2；並且

Ra_3係甲基、乙基、正丙基、異丙基或環丙基甲基。

【0052】 所述具有式I-5之化合物的較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是氫、C_1-C_6烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6炔基、C_3-C_6環烷基C_1-C_4烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6鹵代烯基、C_3-C_6鹵代環烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷氧基的化合物。

【0053】 所述具有式I-5之化合物的另一個較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6炔基、C_3-C_6環烷基C_1-C_4烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6鹵代烯基、C_3-C_6鹵代環烷基、C_1-C_6烷氧基、

C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_6鹵代烷氧基、C_1-C_4烷基磺醯基、C_3-C_6環烷基磺醯基、C_1-C_4烷基羰基、C_3-C_6環烷基羰基、C_1-C_4烷氧基羰基或氰基的化合物。

【0054】 在具有式I-5之化合物的較佳的組中，A較佳的是N；Xa_3較佳的是S或SO_2，更較佳的是SO_2；並且Ra_3較佳的是乙基。在具有式I-5之化合物的進一步較佳的組中，A較佳的是CH；Xa_3較佳的是S或SO_2，更較佳的是SO_2；並且Ra_3較佳的是乙基。

【0055】 在具有式I-5之化合物的另一個較佳的組中，X_1較佳的是NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基，更較佳的是甲基；並且R_2較佳的是C_1-C_6鹵代烷基，更較佳的是三氟甲基。

【0056】 在上文提及的具有式I-5之化合物和具有式I-5之化合物的所有較佳的實施方式中，除非另有說明，R_4和R_5係如上文在式I下所定義的。具有式I-5之化合物的所述尤其較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是氫或C_1-C_6烷基，甚至更較佳的是氫、甲基或乙基的化合物。

【0057】 在進一步較佳的實施方式中，所述具有式I-5之化合物包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基，甚至更較佳的是甲基或乙基的那些。

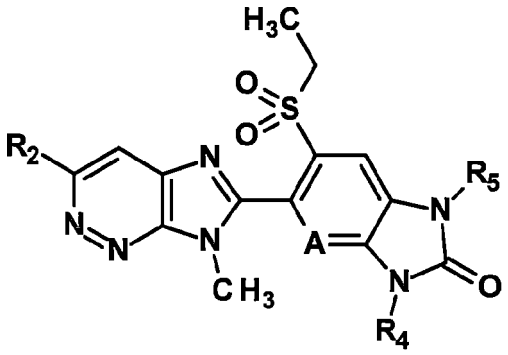
【0058】 所述具有式I-5之化合物的另一個較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基的化合物。

【0059】 具有式I-5之化合物的所述尤其較佳的組的又另一個較佳的實施方式包括如下化合物，其中

R_5係C_1-C_6烷基，甚至更較佳的是甲基或乙基；並且

R_4係C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【0060】 具有式I之化合物的另一個較佳的組由具有式I-6之化合物表示



(I-6)，

其中

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是氫或C_1-C_6烷基，較佳的是氫、甲基或乙基。

【0061】 在進一步較佳的實施方式中，所述具有式I-6之化合物包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基，較佳的是甲基或乙基的那些。

【0062】 具有式I-6之化合物的所述較佳的組的另一個較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5係甲基的化合物。

【0063】 在具有式I-6之化合物的另一個較佳的組中，

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三

氟甲基磺醯基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【0064】 在具有式I-6之化合物的進一步較佳的組中，

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【0065】 在具有式I-6之化合物的又另一個較佳的組中，

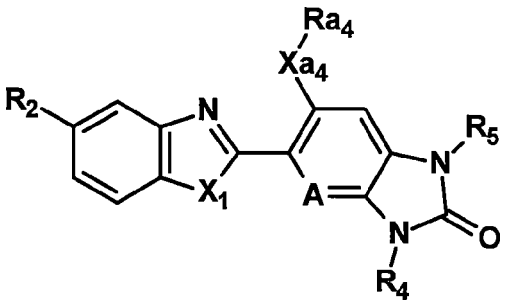
A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基；

R_5係C_1-C_6烷基，甚至更較佳的是甲基或乙基；並且

R_4係C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【0066】 具有式I之化合物的進一步較佳的組由具有式I-7之化合物表示



(I-7)，

其中R_2、X_1和A係如上文在式I下所定義的；並且其中Xa_4係S、SO或SO_2；Ra_4係甲基、乙基、正丙基、異丙基或環丙基甲基；並且R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6炔基、C_3-C_6環烷基C_1-C_4烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6鹵代烯基、C_3-C_6鹵代環烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_6鹵代烷氧基、C_1-C_4烷基磺醯基、C_3-C_6環烷基磺醯基、C_1-C_4烷基羰基、C_3-C_6環烷基羰基、C_1-C_4烷氧基羰基或氰基。

【0067】 在具有式I-7之化合物的較佳的組中，A較佳的是N；Xa_4較佳的是S或SO_2，更較佳的是SO_2；並且Ra_4較佳的是乙基。在具有式I-7之化合物的進一步較佳的組中，A較佳的是CH；Xa_4較佳的是S或SO_2，更較佳的是SO_2；並且Ra_4較佳的是乙基。

【0068】 在具有式I-7之化合物的另一個較佳的組中，X_1較佳的是O或NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基，較佳的是甲基；並且R_2較佳的是C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，更較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基。甚至更特別較佳的是如下那些化合物，其中X_1係O；並且R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，更較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基或三氟甲基磺醯基。還更特別較佳的是如下那些化合物，其中X_1係NCH_3；並且R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，更較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基或三氟甲基磺醯基。

【0069】 在上文提及的具有式I-7之化合物和具有式I-7之化合物的所有較佳的實施方式中，除非另有說明，R_4和R_5係如上文在式I-7下所定義的。所述具有式I-7之化合物的進一步較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基，甚至更較佳的是甲基或乙基的化合物。

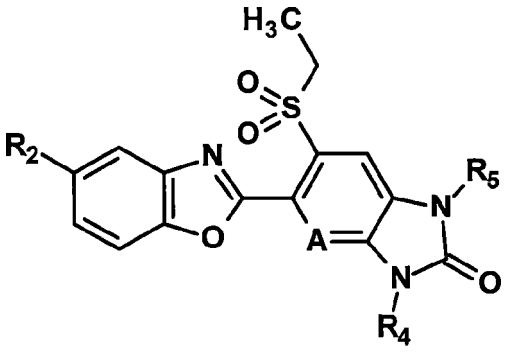
【0070】 所述具有式I-7之化合物的另一個較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基的化合物。

【0071】 所述具有式I-7之化合物的又另一個較佳的實施方式包括如下化合物，其中

R_5係C_1-C_6烷基，甚至更較佳的是甲基或乙基；並且

R_4係C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【0072】 具有式I之化合物的另一個較佳的組由具有式I-8之化合物表示



(I-8)，

其中

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基，較佳的是甲基或乙基。

【0073】 所述具有式I-8之化合物的另一個較佳的實施方式包括其中的R_2係C_1-C_4鹵代烷基氫硫基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基氫硫基或三氟甲基磺醯基的化合物。

【0074】 所述具有式I-8之化合物的進一步較佳的實施方式包括其中的R_2係C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基的化合物。

【0075】 所述具有式I-8之化合物的又另一個較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5係甲基的化合物。

【0076】 所述具有式I-8之化合物的尤其較佳的實施方式包括如下化合物，其中

R_2係C_1-C_4鹵代烷基氫硫基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基氫硫基或三氟甲基磺醯基；並且

R_4和R_5係甲基。

【0077】 所述具有式I-8之化合物的另一個尤其較佳的實施方式包括如下化合物，其中

R_2係C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基；並且

R_4和R_5係甲基。

【0078】 在具有式I-8之化合物的進一步較佳的組中，

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【0079】 在具有式I-8之化合物的又另一個較佳的組中，

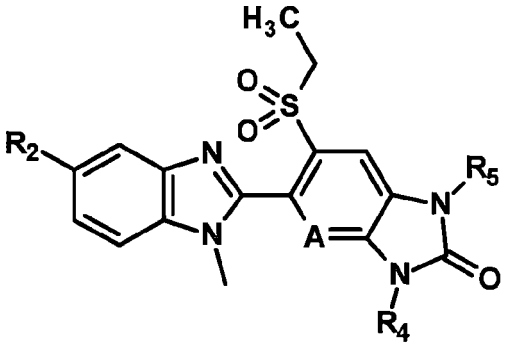
A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基或三氟甲基磺醯基；

R_5係C_1-C_6烷基，甚至更較佳的是甲基或乙基；並且

R_4係C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【0080】 具有式I之化合物的另一個較佳的組由具有式I-8a之化合物表示



(I-8a)，

其中

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基，較佳的是甲基或乙基。

【0081】 所述具有式I-8a之化合物的另一個較佳的實施方式包括其中的R_2係C_1-C_4鹵代烷基氫硫基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基氫硫基或三氟甲基磺醯基的化合物。

【0082】 所述具有式I-8a之化合物的進一步較佳的實施方式包括其中的R_2係C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基的化合物。

【0083】 所述具有式I-8a之化合物的又另一個較佳的實施方式包括其中的R_4和R_5係甲基的化合物。

【0084】 所述具有式I-8a之化合物的尤其較佳的實施方式包括如下化合物，其中

R_2係C_1-C_4鹵代烷基氫硫基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基氫硫基或三氟甲基磺醯基；並且

R_4和R_5係甲基。

【0085】 所述具有式I-8a之化合物的另一個尤其較佳的實施方式包括如下化合物，其中

R_2係C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基；並且

R_4和R_5係甲基。

【0086】 在具有式I-8a之化合物的進一步較佳的組中，

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【0087】 在具有式I-8a之化合物的又另一個較佳的組中，

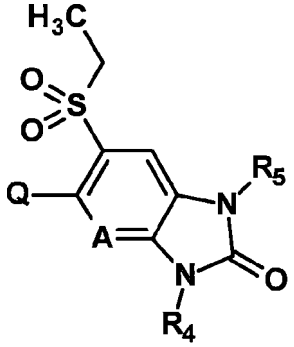
A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基或三氟甲基磺醯基；

R_5係C_1-C_6烷基，甚至更較佳的是甲基或乙基；並且

R_4係C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【0088】 具有式I之化合物的另一個較佳的組由具有式I-9之化合物表示



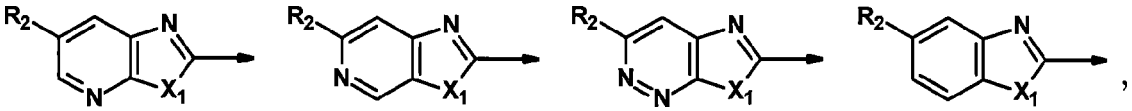
(I-9)，

其中

A係CH或N；

R_4和R_5彼此獨立地是氫或C_1-C_6烷基，較佳的是氫、甲基或乙基；並且

Q係選自下組的基團，該組由下式組成：Q_1、Q_2、Q_3和Q_4



Q_1 Q_2 Q_3 Q_4

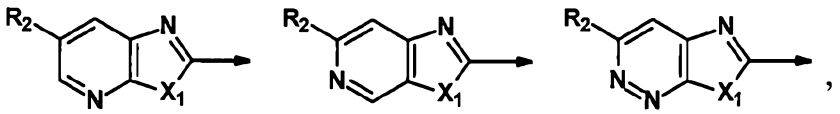
其中箭頭表示與摻入了基團A的雙環的附接點，

並且其中

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基或三氟甲基磺醯基；特別地，R_2係C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基；並且

X_1係O或NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基，較佳的是甲基；特別地，X_1係NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基，更較佳的是甲基。

在具有式I-9之化合物的較佳的組中，Q選自下組，該組由下式組成：Q_1、Q_2和Q_3；



Q_1 Q_2 Q_3

其中箭頭表示與摻入了基團A的雙環的附接點；

並且其中

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基或三氟甲基磺醯基；特別地，R_2係C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基；並且

X_1係O或NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基，較佳的是甲基；特別地，X_1係NR_3，其中R_3

係C_1-C_4烷基，更較佳的是甲基。

【0089】 在具有式I-9之化合物的較佳的組中，R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基，較佳的是甲基或乙基。

在具有式I-9之化合物的另一個較佳的組中，R_2係C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基；並且X_1係NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基，更較佳的是甲基

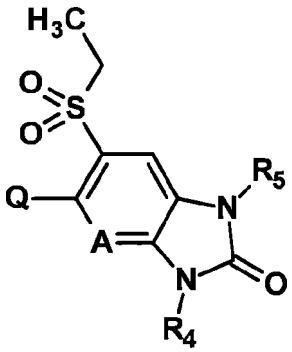
在具有式I-9之化合物的另一個較佳的組中，

A係CH或N；

R_2係C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基，較佳的是甲基或乙基。

【0090】 具有式I之化合物的進一步特別較佳的組由具有式I-10之化合物表示



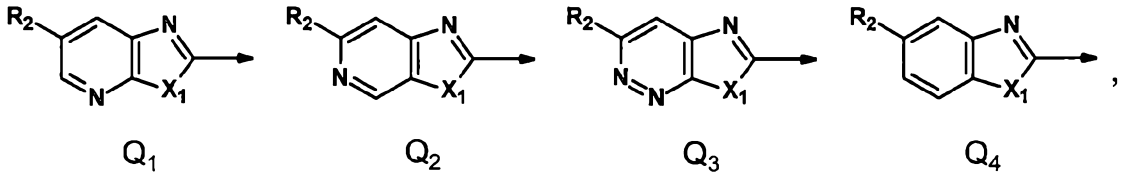
(I-10)，

其中

A係CH或N；

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基；並且

Q係選自下組的基團，該組由下式組成：Q_1、Q_2、Q_3和Q_4



Q_1 Q_2 Q_3 Q_4

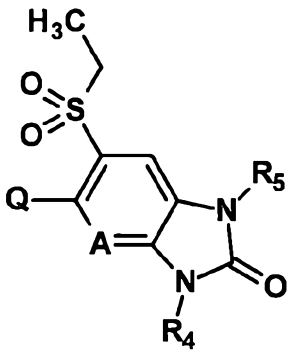
其中箭頭表示與摻入了基團A的雙環的附接點；

並且其中

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

X_1係O或NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基，較佳的是甲基。

【0091】 具有式I之化合物的另一個特別較佳的組由具有式I-11之化合物表示



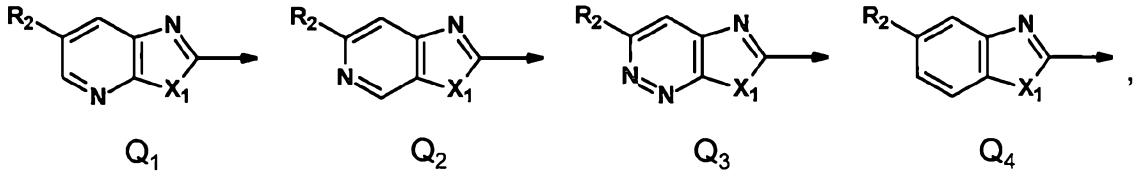
(I-11)，

其中

A係CH或N；

R_4和R_5係甲基；並且

Q係選自下組的基團，該組由下式組成：Q_1、Q_2、Q_3和Q_4



Q_1 Q_2 Q_3 Q_4

其中箭頭表示與摻入了基團A的雙環的附接點；

並且其中

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

X_1係O或NCH_3。

【0092】 根據本發明的用於製備具有式I之化合物的方法藉由熟習該項技術者已知的方法來進行。更具體地，具有式I之化合物（其中X係SO（亞碸）和/或SO_2（碸））的亞組可以借助對應的具有式I之硫化物化合物（其中X係S）的氧化反應來獲得，該氧化反應涉及試劑例如像間氯過氧苯甲酸（mCPBA）、過氧化氫、過硫酸氫鉀（oxone）、過碘酸鈉、次氯酸鈉或次氯酸三級丁酯以及其他氧化劑。該氧化反應通常是在溶劑的存在下進行的。待用於該反應的溶劑的實例包括脂族鹵代烴，如二氯甲烷和氯仿；醇，如甲醇和乙醇；乙酸；水；及其混合物。待用於該反應的氧化劑的量通常是1至3莫耳，較佳的是1至1.2莫耳，相對於1莫耳的硫化物化合物I，以產生亞碸化合物I，並且較佳的是2至2.2莫耳的氧化劑，相對於1莫耳的硫化物化合物I，以產生碸化合物I。此類氧化反應揭露於例如WO 2013/018928中。

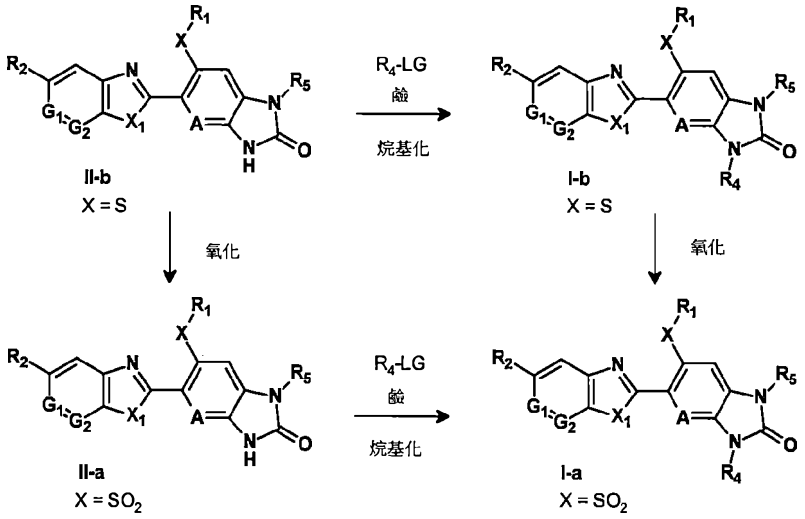
【圖式簡單說明】

無。

【實施方式】

【0093】 具有式I之化合物（其中X係SO_2，定義了具有式I-a之化合物，並且其中A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2、R_4和R_5係如在式I中所定義的）

流程1：



【0094】 可以在上文已經描述的標準氧化條件下由具有式I之化合物（其中X係S，定義了具有式I-b之化合物，並且其中A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2、R_4和R_5係如在式I中所定義的）藉由氧化步驟來製備（流程1）。

【0095】 具有式I-b之化合物（其中X係S，並且其中A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2、R_4和R_5係如在式I中所定義的）可以藉由在0°C與150°C之間的溫度下，在適當的溶劑（例如像四氫呋喃、二噁烷、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺或乙腈）中，在鹼（如碳酸鈉、碳酸鉀或碳酸銫、或氫化鈉）的存在下，用具有式R_4-LG的試劑（其中R_4係如在式I中所定義的，並且其中LG係離去基團如鹵素，較佳的是碘、溴或氯）烷基化具有式II-b之化合物（其中X係S，並且其中A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2和R_5係如在式I中所定義的）來製備。

【0096】 可替代地，具有式I-a之化合物（其中X係SO_2）可以藉由涉及如上文所述的相同的化學過程但藉由改變步驟的順序（即，藉由經由氧化運行順序II-b（X係S）至II-a（X係SO_2），隨後係用R_4-LG進行的烷基化步驟以形成I-a（X係SO_2））由具有式II-b之化合物（其中X係S）來製備。

【0097】 具有式R_4-LG的試劑（其中R_4係如在式I中所定義的，並且其中LG係離去基團如鹵素，較佳的是碘、溴或氯）可以是已知的，可商購的或可以藉由熟習該項技術者已知的方法來製備。上文所述的用於產生具有式I-b之化合

物（由II-b）和具有式I-a之化合物（由II-a）的烷基化製備條件也適用於R_4係C_1-C_4烷基磺醯基、C_3-C_6環烷基磺醯基、C_1-C_4烷基羰基、C_3-C_6環烷基羰基、C_1-C_4烷氧基羰基或氰基的具體情形。具有式R_4-LG的典型試劑則例如是溴化氰（R_4 = CN）、環丙烷磺醯氯（R_4 = 環丙基磺醯基）或環丙烷甲醯氯（R_4 = 環丙基羰基）。在該等情況下，上文所述的鹼可以有利地用例如三乙胺、N,N-二異丙基乙胺或吡啶替代。

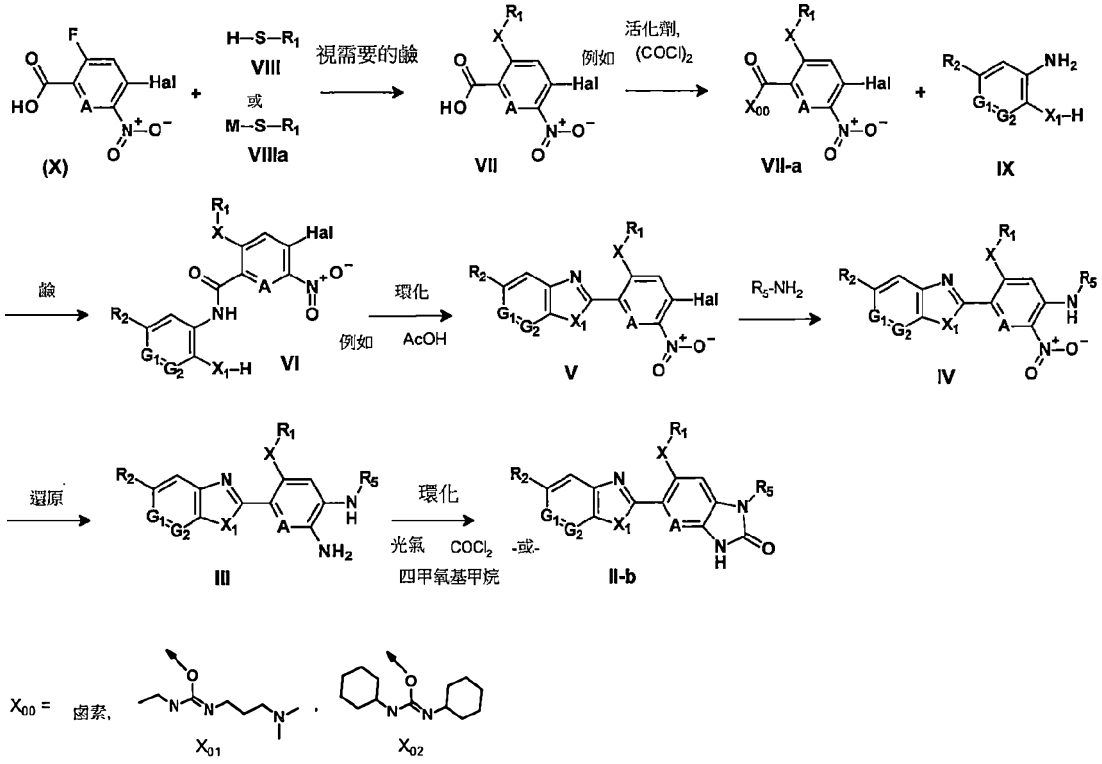
【0098】 可以在本文件的上下文中所述的條件下用合適的氧化劑將具有式I之化合物（其中R_4係C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基）氧化成具有式I之化合物（其中R_4係C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基）。

【0099】 可以在本文件的上下文中所述的條件下用合適的氧化劑將具有式I、I-a和/或I-b之化合物（其中R_2係C_1-C_4鹵代烷基氫硫基）氧化為具有式I、I-a和/或I-b之化合物（其中R_2係C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基和/或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基）。此類過程也已經描述於例如WO 17/146220和WO 14/104407中。具有式II-b之化合物（其中X係S，並且其中A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2和R_5係如在式I中所定義的）可以藉由在0ºC與80ºC之間（較佳的是在0ºC與50ºC之間）的溫度下，在惰性溶劑中，較佳的是在鹼（如三乙胺、N,N-二異丙基乙胺或吡啶）的存在下，在光氣$COCl_2$或其替代物（如雙光氣或三光氣）的存在下，環化具有式III之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X係S，並且其中A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2和R_5係如在式I中所定義的）來製備（流程2）。待使用的溶劑的實例包括醚，如四氫呋喃、乙二醇二甲醚、三級丁基甲基醚和1,4-二噁烷；芳香烴，如甲苯和二甲苯；鹵代烴，如二氯甲烷和氯仿；腈，如乙腈；或極性非質子溶劑，如N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基-2-吡咯啶酮或二甲亞碸。某些鹼（如吡啶和三乙胺）可以成功地用作鹼和溶劑兩者。

【0100】 可替代地，具有式II-b之化合物可以藉由視需要在微波照射下，在0ºC與180ºC之間（較佳的是在20ºC與150ºC之間）的溫度下，有利地在同時用作溶劑或稀釋劑的乙酸或三氟乙酸中，較佳的是在酸的存在下，在四甲氧基甲烷的存在下，環化具有式III之化合物來製備。

【0101】 具有式III之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X係S，並且其中A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2和R_5係如在式I中所定義的）可以藉由在熟習該項技術者已知的條件下還原具有式IV之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X係S，並且其中A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2和R_5係如在式I中所定義的）來製備，例如像在0ºC與120ºC之間（較佳的是在室溫與回流溫度之間）的溫度下，在醇溶劑（例如像甲醇或乙醇）中或在惰性溶劑（例如像乙酸乙酯）中，通常在催化劑（如鎳、鈀（例如鈀炭，通常為5%-10% Pd/C）或鉑）的存在下，視需要在壓力下，使用鋅粉和乙酸或三氟乙酸或其混合物，或使用分子氫（H_2）。

流程2：



【0102】 具有式IV之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X係S，並且其中A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2和R_5係如在式I中所定義的）可以藉由視需要在另外的鹼的存在下，使具有式V之化合物（其中X係S，並且其中A、R_1、R_2、X_1、G_1和G_2係如在式I中所定義的，並且其中Hal係鹵素，例如像氟、氯或溴（較佳的是氟或氯））與試劑R_5-NH_2或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中R_5係如在式I中所定義的）反應來製備。此轉化視需要在微波照射下或使用高壓釜的加壓條件下，在0°C-150°C之間的溫度下（較佳的是在範圍從室溫至反應混合物的沸點的溫度下），較佳的是在合適的溶劑（或稀釋劑）（如醇、醯胺、酯、醚、腈和水，特別較佳的是甲醇、乙醇、2,2,2-三氟乙醇、丙醇、異丙醇、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、二噁烷、四氫呋喃、二甲氧基乙烷、乙腈、乙酸乙酯、水或其混合物）中進行。

【0103】 具有式V之化合物（其中X係S，並且其中A、R_1、R_2、X_1、G_1和G_2係如在式I中所定義的，並且其中Hal係鹵素，例如像氟、氯或溴（較佳的是

氟或氯））可以藉由視需要在微波照射下，在0ºC與180ºC之間（較佳的是在20ºC與150ºC之間）的溫度下，例如藉由在乙酸或三氟乙酸中加熱（較佳的是當X_1係NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基時），環化具有式VI之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）或其區域異構物（regioisomer）或其異構物混合物（以任何比例）（其中X係S，並且其中A、R_1、R_2、X_1、G_1和G_2係如在式I中所定義的，並且其中Hal係鹵素，例如像氟、氯或溴（較佳的是氟或氯））來製備（流程2續）。也可以在25ºC-180ºC（較佳的是100ºC-170ºC）之間的溫度下，在惰性溶劑（如N-甲基吡咯啶酮或二甲苯）中，在酸催化劑（例如甲磺酸或對甲苯磺酸p-TsOH）的存在下環化具有式VI之化合物。此類方法先前已經描述在WO 2010/125985中。可替代地，可以在20ºC-50ºC之間的溫度下，在惰性溶劑（如四氫呋喃THF）中，使用三苯基膦、二異丙基偶氮二甲酸酯（或二乙基偶氮二甲酸酯）將具有式VI之化合物轉化成具有式V之化合物（較佳的是當X_1係O時）。先前已經針對該等轉化描述了此類光延反應（Mitsunobu）條件（參見WO 2009/131237）。

【0104】 具有式VI之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）或其區域異構物或其異構物混合物（以任何比例）（其中X係S，並且其中A、R_1、R_2、X_1、G_1和G_2係如在式I中所定義的，並且其中Hal係鹵素，例如像氟、氯或溴（較佳的是氟或氯））可以藉由如下方式來製備：

i) 藉由熟習該項技術者已知且描述於例如Tetrahedron [四面體], 2005, 61 (46), 10827-10852中的方法活化具有式VII之化合物（其中X係S，並且其中A和R_1係如在式I中所定義的，並且其中Hal係鹵素，例如像氟、氯或溴（較佳的是氟或氯））以形成活化物質VII-a（其中X係S，並且其中A和R_1係如在式I中所定義的，並且其中Hal係鹵素，例如像氟、氯或溴（較佳的是氟或氯），並且其中X_{00}

係鹵素，較佳的是氯）。例如，化合物VII-a（其中X_{00}係鹵素，較佳的是氯）係藉由在20ºC至100ºC之間（較佳的是25ºC）的溫度下，在惰性溶劑（如二氯甲烷CH_2Cl_2或四氫呋喃THF）中，在催化量的N,N-二甲基甲醯胺DMF的存在下，用例如草醯氯$(COCl)_2$或亞硫醯氯$SOCl_2$處理VII而形成的。可替代地，在50ºC-180ºC之間的溫度下，視需要在鹼（如三乙胺）的存在下，在惰性溶劑（如吡啶或四氫呋喃THF）中，用例如1-乙基-3-(3-二甲基胺基丙基)碳二亞胺EDC或二環己基碳二亞胺DCC處理具有式VII之化合物將產生活化物質VII-a（其中X_{00}分別是X_{01}或X_{02}）；隨後

ii) 在0ºC與50ºC之間的溫度下，在惰性溶劑（如二氯甲烷、四氫呋喃、二噁烷，N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、乙腈、乙酸乙酯或甲苯）中，在鹼（如三乙胺、N,N-二異丙基乙胺或吡啶）的存在下，用具有式IX之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中R_2、X_1、G_1和G_2係如在式I中所定義的）處理活化物質VII-a以形成具有式VI之化合物。

【0105】 具有式VI之化合物可以如所繪製的結構性地形成，或可以形成為其區域異構物（VI的位置異構物），或甚至可以作為區域異構醯化產物的混合物出現，如例如WO 16/091731所述。本發明涵蓋全部比例的所有此類異構物形式及其混合物。

【0106】 具有式VII之化合物（其中X係S，並且其中A和R_1係如在式I中所定義的，並且其中Hal係鹵素，例如像氟、氯或溴（較佳的是氟或氯））可以藉由使具有式 (X) 之化合物（其中A係如在式I中所定義的，並且其中Hal係鹵素，例如像氟、氯或溴（較佳的是氟或氯））與具有式VIII之試劑

$$R_1\text{-}SH \qquad (VIII),$$

或其鹽（其中R_1係如在式I中所定義的）在較佳的是25ºC-120ºC之間的溫度下，

在惰性溶劑中，視需要在合適的鹼（如鹼金屬碳酸鹽例如碳酸鈉和碳酸鉀，或鹼金屬氫化物如氫化鈉，或鹼金屬氫氧化物如氫氧化鈉和氫氧化鉀，或三級丁醇鈉或三級丁醇鉀）的存在下反應來製備。待使用的溶劑的實例包括醚，如四氫呋喃THF、乙二醇二甲醚、三級丁基甲基醚和1,4-二噁烷；芳香烴，如甲苯和二甲苯；腈，如乙腈；或極性非質子溶劑，如N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基-2-吡咯啶酮NMP或二甲亞碸。具有式VIII之化合物的鹽的實例包括具有式VIIIa之化合物

$$R_1\text{-S-M} \qquad \text{(VIIIa)},$$

其中R_1係如上文所定義的並且其中M係例如鈉或鉀。製備具有式VII之化合物的這種方法可以在例如WO 16/091731中找到。

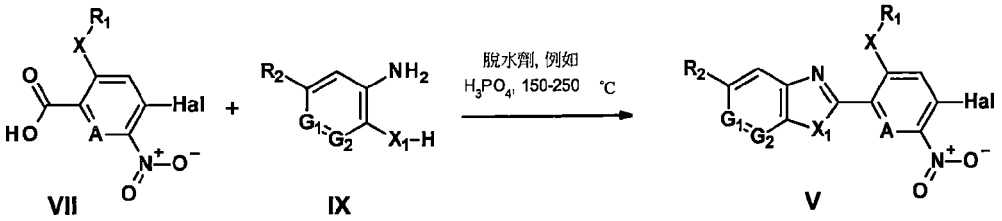
【0107】 具有式 (X) 之化合物（其中A係如在式I中所定義的，並且其中Hal係鹵素，例如像氟、氯或溴（較佳的是氟或氯））可以是已知的，可商購的或可以藉由熟習該項技術者已知的方法來製備。

【0108】 具有式$R_5\text{-}NH_2$的試劑或其鹽（其中R_5係如上文所定義的）可以是已知的，可商購的或可以藉由熟習該項技術者已知的方法來製備。

【0109】 具有式IX之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中R_2、X_1、G_1和G_2係如在式I中所定義的）可以是已知的，可商購的或可以藉由熟習該項技術者已知的方法來製備。具體參見WO 16/005263（IX，其中$R_2 = CF_3$；$G_1 = N$；$G_2 = CH$；並且$X_1 = NCH_3$）、WO 16/142327（IX，其中$R_2 = CF_3$；$G_1 = CH$；$G_2 = N$；並且$X_1 = NCH_3$）、WO 16/059145（IX，其中$R_2 = CF_3$；$G_1 = N$；$G_2 = N$；並且$X_1 = NCH_3$）、WO 15/198859（IX，其中$R_2 = SCF_3$；$G_1 = CH$；$G_2 = CH$；並且$X_1 = NCH_3$）、US 3361750（IX，其中$R_2 = SCF_3$；$G_1 = CH$；$G_2 = CH$；並且$X_1 = O$）和JP 7082267（IX，其中$R_2 = SO_2CF_3$；$G_1 = CH$；$G_2 = CH$；並且$X_1 = O$）。

【0110】 也可以藉由如下方式製備具有式V之化合物：

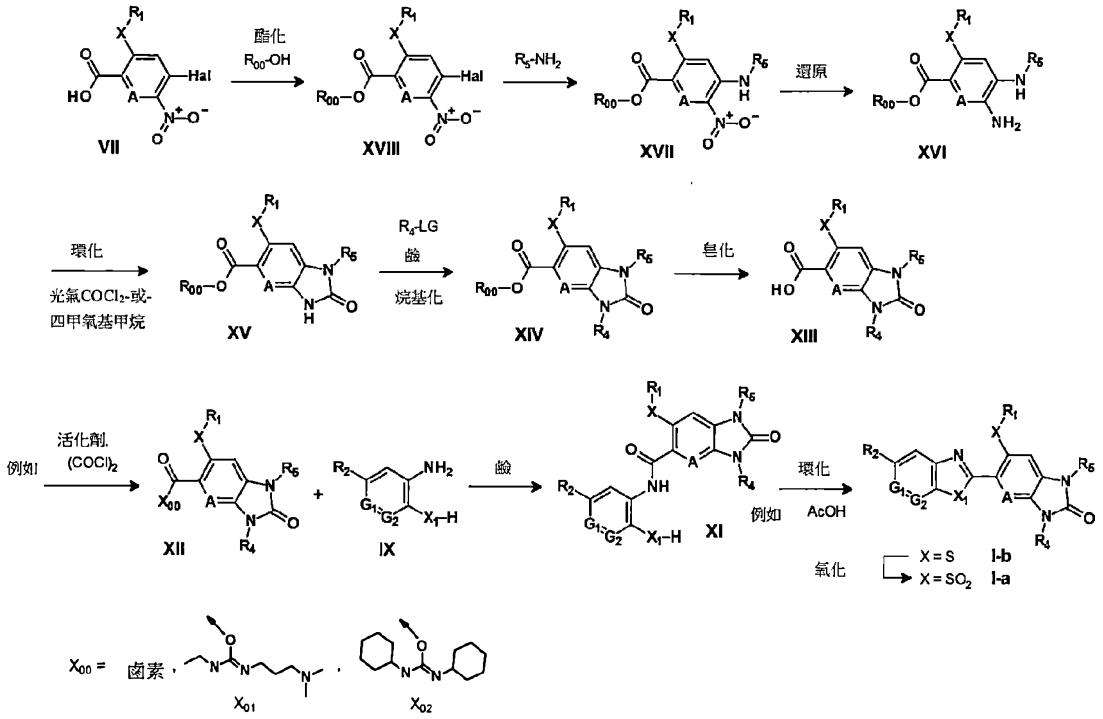
流程2a：



在各種形式的脫水條件下，使具有式VII之化合物和具有式IX之化合物（其中取代基定義係如上文所述的）縮合（流程2a），例如在脫水劑（如多磷酸）的存在下，在150°C至250°C之間的溫度下，並且不分離具有式VI之中間體化合物或其區域異構物或其異構物混合物（以任何比例）。此類方法係眾所周知的並且已經描述於例如WO 2011/040629或WO 2009/131237（X_1係氧）以及J.Am.Chem.Soc. [美國化學會誌], 132(5), 1545-1557, 2010或WO 2008/128968（X_1係NR_3）中。

【0111】 可替代地，具有式I-a之化合物（其中X係SO_2）（對應地具有式I-b之化合物，其中X係S）可以藉由涉及如上文在流程1和2中所述的相同的化學過程但藉由改變如流程3中所示的步驟的順序由具有式VII之化合物（其中X係S）來製備。具有式I-b之化合物（其中X係S，並且其中A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2、R_4和R_5係如在式I中所定義的）。

流程3：



【0112】 可以藉由視需要在微波照射下，在0ºC與180ºC之間（較佳的是在20ºC與150ºC之間）的溫度下，例如藉由在乙酸或三氟乙酸中加熱（較佳的是當X_1係NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基時），環化具有式XI之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）或其區域異構物或其異構物混合物（以任何比例）（其中X係S，並且其中A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2、R_4和R_5係如在式I中所定義的）來製備。也可以在25ºC-180ºC（較佳的是100ºC-170ºC）之間的溫度下，在惰性溶劑（如N-甲基吡咯啶酮或二甲苯）中，在酸催化劑（例如甲磺酸或對甲苯磺酸p-TsOH）的存在下環化具有式XI之化合物。此類方法先前已經描述在WO 2010/125985中。可替代地，可以在20ºC-50ºC之間的溫度下，在惰性溶劑（如四氫呋喃THF）中，使用三苯基膦、二異丙基偶氮二甲酸酯（或二乙基偶氮二甲酸酯）將具有式XI之化合物轉化成具有式I-b之化合物（較佳的是當X_1係O時）。先前已經針對該等轉化描述了此類光延反應條件（參見WO 2009/131237）。

【0113】 具有式XI之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫

溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）或其區域異構物或其異構物混合物（以任何比例）（其中X係S，並且其中A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2、R_4和R_5係如在式I中所定義的）可以藉由如下方式來製備：

i) 藉由熟習該項技術者已知且描述於例如Tetrahedron [四面體], 2005, 61 (46), 10827-10852中的方法活化具有式XIII之化合物（其中X係S，並且其中A、R_1、R_4和R_5係如在式I中所定義的）以形成活化物質XII（其中X係S，並且其中A、R_1、R_4和R_5係如在式I中所定義的，並且其中X_{00}係鹵素，較佳的是氯）。例如，化合物XII（其中X_{00}係鹵素，較佳的是氯）係藉由在20ºC至100ºC之間（較佳的是25ºC）的溫度下，在惰性溶劑（如二氯甲烷CH_2Cl_2或四氫呋喃THF）中，在催化量的N,N-二甲基甲醯胺DMF的存在下，用例如草醯氯$(COCl)_2$或亞硫醯氯$SOCl_2$處理XIII而形成的。可替代地，在50ºC-180ºC之間的溫度下，視需要在鹼（如三乙胺）的存在下，在惰性溶劑（如吡啶或四氫呋喃THF）中，用例如1-乙基-3-(3-二甲基胺基丙基)碳二亞胺EDC或二環己基碳二亞胺DCC處理具有式XIII之化合物將產生活化物質XII（其中X_{00}分別是X_{01}或X_{02}）；隨後

ii) 在0ºC與50ºC之間的溫度下，在惰性溶劑（如二氯甲烷、四氫呋喃、二噁烷、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、乙腈、乙酸乙酯或甲苯）中，在鹼（如三乙胺、N,N-二異丙基乙胺或吡啶）的存在下，用具有式IX之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中R_2、X_1、G_1和G_2係如在式I中所定義的）處理活化物質XII以形成具有式XI之化合物。

【0114】 具有式XI之化合物可以如所繪製的結構性地形成，或可以形成為其區域異構物（XI的位置異構物），或甚至可以作為區域異構醯化產物的混合物出現，如例如WO 16/091731所述。本發明涵蓋全部比例的所有此類異構物形式及其混合物。

【0115】 具有式XIII之化合物（其中X係S，並且其中A、R_1、R_4和R_5係如在式I中所定義的）可以藉由皂化具有式XIV之化合物（其中X係S，並且其中A、R_1、R_4和R_5係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基）來製備。這種反應的條件（通常在鹼的存在下藉由水進行水解）係熟習該項技術者已知的（例如使用：在室溫下或高達回流條件下，甲醇、乙醇、四氫呋喃或二噁烷中的水性氫氧化鈉、氫氧化鉀或氫氧化鋰；或者可替代地，在0ºC與150ºC之間的溫度下，視需要在溶劑（如四氫呋喃、二噁烷或二氯甲烷）的存在下，用酸（例如像氫鹵酸（較佳的是鹽酸或氫溴酸）或三氟乙酸）處理具有式XIV之化合物）。

【0116】 具有式XIV之化合物（其中X係S，並且其中A、R_1、R_4和R_5係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基）可以藉由在0ºC與150ºC之間的溫度下，在適當的溶劑（例如像四氫呋喃、二噁烷、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺或乙腈）中，在鹼（如碳酸鈉、碳酸鉀或碳酸銫、或氫化鈉）的存在下，用具有式R_4-LG的試劑（其中R_4係如在式I中所定義的，並且其中LG係離去基團如鹵素，較佳的是碘、溴或氯）烷基化具有式XV之化合物（其中X係S，並且其中A、R_1和R_5係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基）來製備。

【0117】 具有式XV之化合物（其中X係S，並且在A、R_1和R_5係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基）可以藉由在0ºC與80ºC之間（較佳的是在0ºC與50ºC之間）的溫度下，在惰性溶劑中，較佳的是在鹼（如三乙胺、N,N-二異丙基乙胺或吡啶）的存在下，在光氣$COCl_2$或其替代物（如雙光氣或三光氣）的存在下，環化具有式XVI之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X係S，並且其中A、R_1和R_5係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基）來製備（流程3續）。待使用的溶劑的實例包括醚，如四氫呋喃、乙二醇二甲醚、三級丁基甲基醚和1,4-二噁烷；芳香烴，如甲苯和二甲苯；鹵代烴，如二氯甲烷和氯仿；腈，如乙腈；

或極性非質子溶劑，如N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基-2-吡咯啶酮或二甲亞碸。某些鹼（如吡啶和三乙胺）可以成功地用作鹼和溶劑。

【0118】 可替代地，具有式XV之化合物可以藉由視需要在微波照射下，在0ºC與180ºC之間（較佳的是在20ºC與150ºC之間）的溫度下，有利地在同時用作溶劑或稀釋劑的乙酸或三氟乙酸中，較佳的是在酸的存在下，在四甲氧基甲烷的存在下，環化具有式XVI之化合物來製備。

【0119】 具有式XVI之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X係S，並且其中A、R_1和R_5係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基）可以藉由在熟習該項技術者已知的條件下還原具有式XVII之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X係S，並且其中A、R_1和R_5係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基）來製備，例如像在0ºC與120ºC之間（較佳的是在室溫與回流溫度之間）的溫度下，在醇溶劑（例如像甲醇或乙醇）中或在惰性溶劑（例如像乙酸乙酯）中，通常在催化劑（如鎳、鈀（例如鈀炭，通常為5%-10% Pd/C）或鉑）的存在下，視需要在壓力下，使用鋅粉和乙酸或三氟乙酸或其混合物，或使用分子氫（H_2）。

【0120】 具有式XVII之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X係S，並且其中A、R_1和R_5係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基）可以藉由視需要在另外的鹼的存在下，使具有式XVIII之化合物（其中X係S，並且其中A和R_1係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基，並且其中Hal係鹵素，例如像氟、氯或溴（較佳的是氟或氯））與試劑R_5-NH_2或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中R_5係如在式I中所定義的）反應來製備。此轉化視需要在微波照射下或使用高壓釜的加壓條件下，在

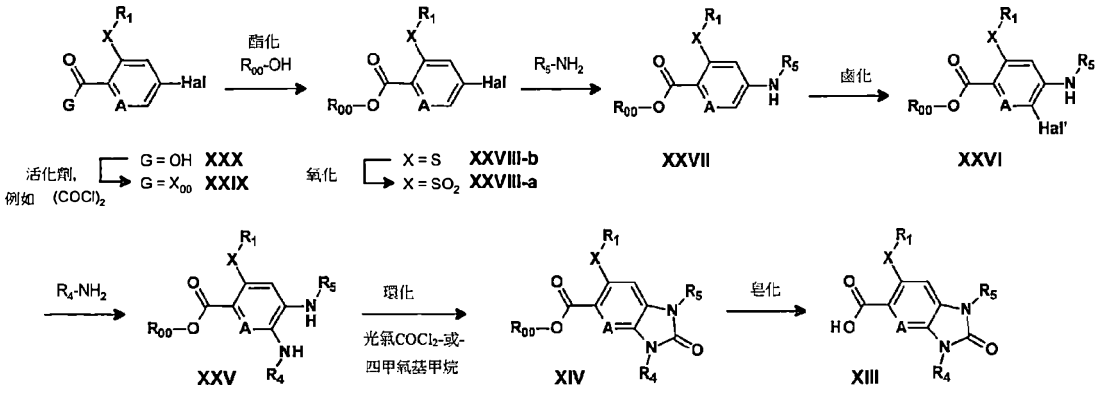
0ºC-150ºC之間的溫度下（較佳的是在範圍從室溫至反應混合物的沸點的溫度下），較佳的是在合適的溶劑（或稀釋劑）（如醇、醯胺、酯、醚、腈和水，特別較佳的是甲醇、乙醇、2,2,2-三氟乙醇、丙醇、異丙醇、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、二噁吅、四氫呋喃、二甲氧基乙烷、乙腈、乙酸乙酯、水或其混合物）中進行。

【0121】 具有式XVIII之化合物（其中X係S，並且其中A和R_1係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基，並且其中Hal係鹵素，例如像氟、氯或溴（較佳的是氟或氯））可以藉由視需要在酸（如硫酸）的存在下，或視需要在活化劑（例如像草醯氯$(COCl)_2$）的存在下，與具有式$R_{00}OH$的醇（其中R_{00}係C_1-C_4烷基）反應由對應的具有式VII之羧酸化合物（其中X係S，並且其中A和R_1係如在式I中所定義的，並且其中Hal係鹵素，例如像氟、氯或溴（較佳的是氟或氯））來製備。此類酯化方法係熟習該項技術者眾所周知的。上文描述了具有式VII之化合物（參見流程2）。

【0122】 具有式$R_{00}OH$的醇化合物（其中R_{00}係C_1-C_4烷基）可以是已知的，可商購的或可以藉由熟習該項技術者已知的方法來製備。

【0123】 可替代地，具有式XIV和XIII之化合物也可以根據流程3a中所述的化學過程來製備。具有式XIII之化合物（其中X係SO_2，並且其中A、R_1、R_4和R_5係如在式I中所定義的）

流程3a：



【0124】 可以藉由在上文已經描述的條件下（參見流程3），皂化具有式XIV之化合物（其中X係SO_2，並且其中A、R_1、R_4和R_5係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基）來製備。

【0125】 具有式XIV之化合物（其中X係SO_2，並且在A、R_1、R_4和R_5係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基）可以藉由在0ºC與80ºC之間（較佳的是在0ºC與50ºC之間）的溫度下，在惰性溶劑中，較佳的是在鹼（如三乙胺、N,N-二異丙基乙胺或吡啶）的存在下，在光氣$COCl_2$或其替代物（如雙光氣或三光氣）的存在下，環化具有式XXV之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X係SO_2，並且其中A、R_1、R_4和R_5係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基）來製備。待使用的溶劑的實例包括醚，如四氫呋喃、乙二醇二甲醚、三級丁基甲基醚和1,4-二噁烷；芳香烴，如甲苯和二甲苯；鹵代烴，如二氯甲烷和氯仿；腈，如乙腈；或極性非質子溶劑，如N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基-2-吡咯啶酮或二甲亞碸。某些鹼（如吡啶和三乙胺）可以成功地用作鹼和溶劑。可替代地，具有式XIV之化合物可以藉由視需要在微波照射下，在0ºC與180ºC之間（較佳的是在20ºC與150ºC之間）的溫度下，有利地在同時用作溶劑或稀釋劑的乙酸或三氟乙酸中，較佳的是在酸的存在下，在四甲氧基甲烷的存在下，環化具有式XXV的化合物來製備。

【0126】 具有式XXV之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X係SO_2，並且其中A、R_1、R_4和R_5係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基）可以藉由視需要在另外的鹼的存在下，使具有式XXVI之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X係SO_2，並且其中A、R_1和R_5係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基並且Hal'係鹵素例如像氯、溴或碘（較佳的是氯或溴））與試劑R_4-NH_2或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中R_4係如在式I中所定義的）反應來製備。此轉化視需要在微波照射下或使用高壓釜的加壓條件下，在0ºC-150ºC之間的溫度下（較佳的是在範圍從室溫至反應混合物的沸點的溫度下），較佳的是在合適的溶劑（或稀釋劑）（如醇、醯胺、酯、醚、腈和水，特別較佳的是甲醇、乙醇、2,2,2-三氟乙醇、丙醇、異丙醇、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、二噁吅、四氫呋喃、二甲氧基乙烷、乙腈、乙酸乙酯、水或其混合物）中進行。

【0127】 具有式XXVI之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X係SO_2，並且其中A、R_1和R_5係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基並且Hal'係鹵素例如像氯、溴或碘（較佳的是氯或溴））可以藉由鹵化反應來製備，該鹵化反應涉及例如，使具有式XXVII之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X係SO_2，並且其中A、R_1和R_5係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基）與鹵化試劑（如N-氯代琥珀醯亞胺（NCS）、N-溴代琥珀醯亞胺（NBS）或N-碘代琥珀醯亞胺（NIS），或者可替代地氯、溴或碘）反應。此類鹵化反應在20ºC-200ºC（較佳的是室溫至100ºC）之間的溫度下，在惰性溶劑（如氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷、乙酸、

醚、乙腈或N,N-二甲基甲醯胺）中進行。

【0128】 具有式XXVII之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X係SO_2，並且其中A、R_1和R_5係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基）可以藉由視需要在另外的鹼的存在下，並且視需要在催化劑（例如銅基催化劑，如銅粉或碘化銅(I)）的存在下，使具有式XXVIII-a之化合物（其中X係SO_2，並且其中A和R_1係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基並且Hal係鹵素，例如像氯、溴或碘（較佳的是氯或溴））與試劑R_5-NH_2或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中R_5係如在式I中所定義的）反應來製備。此轉化視需要在微波照射下或使用高壓釜的加壓條件下，在0ºC-150ºC之間的溫度下（較佳的是在範圍從室溫至反應混合物的沸點的溫度下），較佳的是在合適的溶劑（或稀釋劑）（如醇、醯胺、酯、醚、腈和水，特別較佳的是甲醇、乙醇、2,2,2-三氟乙醇、丙醇、異丙醇、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、二噁烷、四氫呋喃、二甲氧基乙烷、乙腈、乙酸乙酯、水或其混合物）中進行。

【0129】 可以在上文已經描述的條件下用合適的氧化劑將具有式XXVIII-b之化合物（其中X係S或SO（較佳的是S），並且其中A和R_1係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基並且Hal係鹵素，例如像氯、溴或碘（較佳的是氯或溴））氧化成對應的具有式XXVIII-a之化合物（其中X係SO_2）。

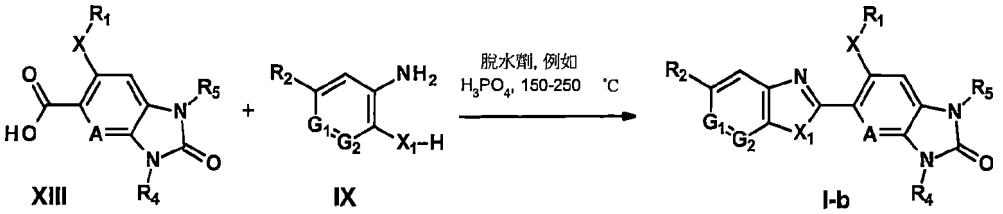
【0130】 具有式XXVIII-b之化合物（其中X係S或SO（較佳的是S），並且其中A和R_1係如在式I中所定義的，並且其中R_{00}係C_1-C_4烷基並且Hal係鹵素，例如像氯、溴或碘（較佳的是氯或溴））可以藉由在熟習該項技術者眾所周知的酯化方法下，視需要在酸（如硫酸）的存在下，與具有式R_{00}OH的醇（其中R_{00}係C_1-C_4烷基）反應由對應的具有式XXX (G = OH)的羧酸化合物（其中X係S或

SO（較佳的是S，並且其中A和R_1係如在式I中所定義的，並且其中Hal係鹵素，例如像氯、溴或碘（較佳的是氯或溴））來製備。可替代地，具有式XXVIII-b之化合物也可以藉由視需要在催化劑（例如像4-二甲基胺基吡啶）的存在下，在0ºC與80ºC之間的溫度下，在惰性溶劑（如二氯甲烷、四氫呋喃、二噁烷或甲苯）中，較佳的是在鹼（如三乙胺、N,N-二異丙基乙胺或吡啶）的存在下與具有式$R_{00}OH$的醇（其中R_{00}係C_1-C_4烷基）反應由對應的具有式XXIX的活化羧酸衍生物（其中取代基係如上文所定義的，並且其中X_{00}係例如氯（G = Cl））來製備。

【0131】 具有式XXX (G = OH) 之化合物（其中X係S，並且其中A和R_1係如在式I中所定義的，並且其中Hal係鹵素，例如像氯、溴或碘（較佳的是氯或溴））可以是已知的，可商購的或可以藉由熟習該項技術者已知的方法來製備。參見例如WO 16/030229（化合物XXX，其中X = S，A = N，$R_1 = CH_2CH_3$，Hal = Br並且G = OH），其還描述了在活化劑（例如像草醯氯$(COCl)_2$）的存在下活化具有XXX式的化合物以形成對應的活化物質XXIX（G = Cl）。

也可以藉由如下方式製備具有式I-b之化合物：

流程3b：

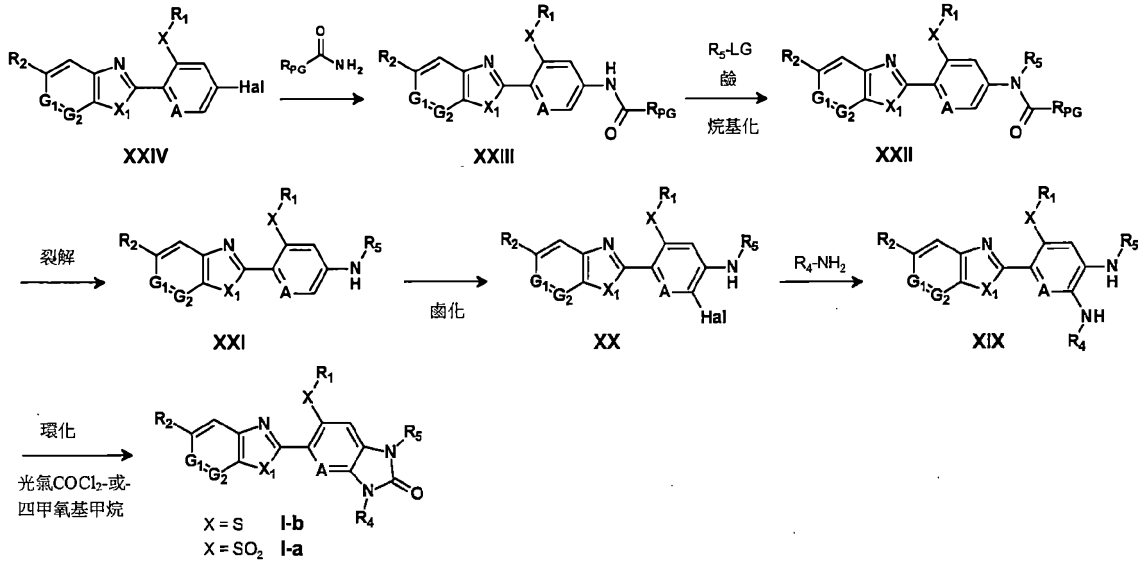


【0132】 在各種形式的脫水條件下，使具有式XIII之化合物和具有式IX之化合物（其中取代基定義係如上文所述的）縮合（流程3b），例如在脫水劑（如多磷酸）的存在下，在150ºC至250ºC之間的溫度下，並且不分離具有式XI之中間體化合物或其區域異構物或其異構物混合物（以任何比例）。此類方法係眾所周知的並且已經描述於例如WO 2011/040629或WO 2009/131237（X_1係氧）以及J.Am.Chem.Soc. [美國化學會誌], 132(5), 1545-1557, 2010或WO 2008/128968

（X_1係NR_3）中。

【0133】 可替代地，具有式I-a之化合物（其中X係SO_2）（對應地具有式I-b之化合物，其中X係S，並且其中A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2、R_4和R_5係如在式I中所定義的）

流程4：



【0134】 可以藉由在0ºC與80ºC之間（較佳的是在0ºC與50ºC之間）的溫度下，在惰性溶劑中，較佳的是在鹼（如三乙胺、N,N-二異丙基乙胺或吡啶）的存在下，在光氣$COCl_2$或其替代物（如雙光氣或三光氣）的存在下，環化具有式XIX之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X、A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2、R_4和R_5係如在式I中所定義的）來製備（流程4）。待使用的溶劑的實例包括醚，如四氫呋喃、乙二醇二甲醚、三級丁基甲基醚和1,4-二噁烷；芳香烴，如甲苯和二甲苯；鹵代烴，如二氯甲烷和氯仿；腈，如乙腈；或極性非質子溶劑，如N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基-2-吡咯啶酮或二甲亞碸。某些鹼（如吡啶和三乙胺）可以成功地用作鹼和溶劑。

【0135】 可替代地，具有式I-a之化合物（對應地具有式I-b之化合物）可以藉由視需要在微波照射下，在0ºC與180ºC之間（較佳的是在20ºC與150ºC之間）

的溫度下，有利地在同時用作溶劑或稀釋劑的乙酸或三氟乙酸中，較佳的是在酸的存在下，在四甲氧基甲烷的存在下，環化具有式XIX之化合物來製備。

【0136】 具有式XIX之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X、A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2、R_4和R_5係如在式I中所定義的）可以藉由視需要在另外的鹼的存在下，使具有式XX之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X、A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2和R_5係如在式I中所定義的，並且其中Hal係鹵素，例如像氯、溴或碘（較佳的是氯或溴））與試劑R_4-NH_2或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中R_4係如在式I中所定義的）反應來製備。此轉化視需要在微波照射下或使用高壓釜的加壓條件下，在0ºC-150ºC之間的溫度下（較佳的是在範圍從室溫至反應混合物的沸點的溫度下），較佳的是在合適的溶劑（或稀釋劑）（如醇、醯胺、酯、醚、腈和水，特別較佳的是甲醇、乙醇、2,2,2-三氟乙醇、丙醇、異丙醇、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、二噁烷、四氫呋喃、二甲氧基乙烷、乙腈、乙酸乙酯、水或其混合物）中進行。

【0137】 具有式XX的化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X、A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2和R_5係如在式I中所定義的，並且其中Hal係鹵素，例如像氯、溴或碘（較佳的是氯或溴））可以藉由鹵化反應來製備，該鹵化反應涉及例如，使具有式XXI的化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X、A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2和R_5係如在式I中所定義的）與鹵化試劑（如N-氯代琥珀醯亞胺（NCS）、N-溴代琥珀醯亞胺（NBS）或N-碘代琥珀醯亞胺（NIS），或者可替代地氯、溴或碘）反應。此類鹵化反應在20ºC-200ºC（較佳的是室溫至100ºC）之間的溫度下，在惰性溶劑（如氯仿、

四氯化碳、1,2-二氯乙烷、乙酸、醚、乙腈或N,N-二甲基甲醯胺）中進行。

【0138】 具有式XXI之化合物或其鹽（如氫鹵化物鹽，較佳的是鹽酸鹽或氫溴酸鹽，或三氟乙酸鹽或任何其他等價鹽）（其中X、A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2和R_5係如在式I中所定義的）可以藉由在0ºC與150ºC之間的溫度下，視需要在溶劑（如四氫呋喃、二噁烷或二氯甲烷）的存在下，視需要在水的存在下，用酸（例如像氫鹵酸（較佳的是鹽酸或氫溴酸）或三氟乙酸）處理具有式XXII之化合物（其中X、A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2和R_5係如在式I中所定義的，並且其中R_{PG}係C_1-C_6烷基、C_1-C_6烷氧基（例如三級丁氧基）、苄氧基或被一個或兩個甲氧基取代的苄氧基，較佳的是R_{PG}係三級丁氧基）來製備（流程4續）。

【0139】 具有式XXII之化合物（其中X、A、R_1、R_2、X_1、G_1、G_2和R_5係如在式I中所定義的，並且其中R_{PG}係C_1-C_6烷基、C_1-C_6烷氧基（例如三級丁氧基）、苄氧基或被一個或兩個甲氧基取代的苄氧基，較佳的是R_{PG}係三級丁氧基）可以藉由在0ºC與150ºC之間的溫度下，在適當的溶劑（例如像四氫呋喃、二噁烷、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺或乙腈）中，在鹼（如碳酸鈉、碳酸鉀或碳酸銫、或氫化鈉）的存在下，使具有式XXIII之化合物（其中X、A、R_1、R_2、X_1、G_1和G_2係如在式I中所定義的，並且其中R_{PG}係C_1-C_6烷基、C_1-C_6烷氧基（例如三級丁氧基）、苄氧基或被一個或兩個甲氧基取代的苄氧基，較佳的是R_{PG}係三級丁氧基）與具有式R_5-LG的試劑（其中R_5係如在式I中所定義的，並且其中LG係離去基團，如鹵素，較佳的是碘、溴或氯）反應來製備。

【0140】 具有式XXIII之化合物（其中X、A、R_1、R_2、X_1、G_1和G_2係如在式I中所定義的，並且其中R_{PG}係C_1-C_6烷基、C_1-C_6烷氧基（例如三級丁氧基）、苄氧基或被一個或兩個甲氧基取代的苄氧基，較佳的是R_{PG}係三級丁氧基）可以藉由較佳的是在惰性氣氛下，在溶劑或溶劑混合物（像例如二噁烷、乙腈或N,N-二甲基甲醯胺）中，在鹼（像碳酸鈉、碳酸鉀或碳酸銫、磷酸三鉀或氟化銫）

的存在下，在膦配位基（如2-二環己基膦基-2',4',6'-三異丙基聯苯基三環己基磷烷XPhos、(1,1'雙(二苯基-膦基)二茂鐵)二氯化鈀-二氯甲烷（1：1錯合物）或氯(2-二環己基膦基-2',4',6'-三異丙基-1,1'-聯苯基)[2-(2'-胺基-1,1'-聯苯基)]鈀(II)(XPhos palladacycle））的存在下，在鈀基催化劑（例如四(三苯基膦)鈀(0)或乙酸鈀(II)或三(二亞苄基丙酮)二鈀(0)）的存在下，使具有式XXIV之化合物（其中X、A、R_1、R_2、X_1、G_1和G_2係如在式I中所定義的，並且其中Hal係鹵素，例如像氯、溴或碘（較佳的是溴或碘））與具有式$R_{PG}C(O)NH_2$的試劑（其中R_{PG}係C_1-C_6烷基、C_1-C_6烷氧基（例如三級丁氧基）、苄氧基或被一個或兩個甲氧基取代的苄氧基，較佳的是R_{PG}係三級丁氧基）反應來製備。反應溫度的範圍可以優先地是從室溫至反應混合物的沸點，或者可以在微波照射下進行反應。

【0141】 具有式R_4-NH_2的試劑或其鹽（其中R_4係如上文所定義的）和具有式R_5-LG的試劑（其中R_5係如在式I中所定義的，並且其中LG係離去基團如鹵素，較佳的是碘、溴或氯）可以是已知的，可商購的或可以藉由熟習該項技術者已知的方法來製備。

【0142】 具有式$R_{PG}C(O)NH_2$（其中R_{PG}係如上文所定義的）可以是已知的，可商購的或可以藉由熟習該項技術者已知的方法來製備。

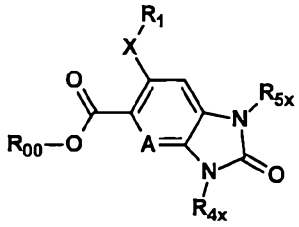
【0143】 具有式XXIV之化合物（其中X、A、R_1、R_2、X_1、G_1和G_2係如在式I中所定義的，並且其中Hal係鹵素，例如像氯、溴或碘（較佳的是溴或碘））係已知的化合物並且可以藉由例如WO 2016/026848中所述的方法來製備。

【0144】 可以在上文已經描述的條件下用合適的氧化劑將具有式XIX至XXIV之任何化合物（流程4）（其中取代基係如上文所定義的，並且其中X係S（硫化物））氧化成對應的化合物（其中X係SO（亞碸）或SO_2（碸））。

【0145】 在一個實施方式中，提供了具有式XIVx、XIIIx、XIIx、II-ab和XIx的化合物，並且該等化合物對於製備具有式I之化合物而言特別有用。下式更

詳細地描述了具有式XIVx、XIIIx、XIIx、II-ab和XIx之化合物：

【0146】 具有式XIVx之化合物，



(XIVx)，

其中

A係CH或N；

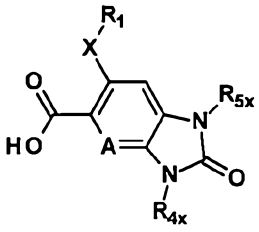
X係S、SO或SO_2，較佳的是S或SO_2，甚至更較佳的是S；

R_1係C_1-C_4烷基，較佳的是乙基；

R_{00}係C_1-C_4烷基，較佳的是甲基、乙基或三級丁基；並且

R_{4x}和R_{5x}彼此獨立地是氫或C_1-C_6烷基，較佳的是氫、甲基或乙基，更較佳的是氫或甲基，甚至更較佳的是甲基。

【0147】 具有式XIIIx之化合物，



(XIIIx)，

其中

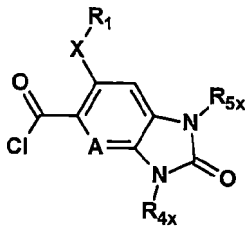
A係CH或N；

X係S、SO或SO_2，較佳的是S或SO_2，甚至更較佳的是S；

R_1係C_1-C_4烷基，較佳的是乙基；並且

R_{4x}和R_{5x}彼此獨立地是氫或C_1-C_6烷基，較佳的是氫、甲基或乙基，更較佳的是氫或甲基，甚至更較佳的是甲基。

【0148】 具有式XIIx之化合物，


(XIIx)，

其中

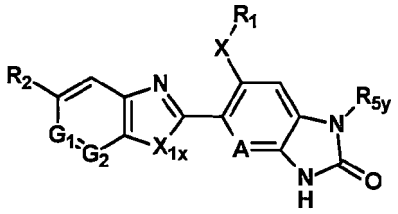
A係CH或N；

X係S、SO或SO_2，較佳的是S或SO_2，甚至更較佳的是S；

R_1係C_1-C_4烷基，較佳的是乙基；並且

R_{4x}和R_{5x}彼此獨立地是氫或C_1-C_6烷基，較佳的是氫、甲基或乙基，更較佳的是氫或甲基，甚至更較佳的是甲基。

【0149】 具有式II-ab之化合物，


(II-ab)，

其中

A係CH或N，較佳的是CH；

X係S、SO或SO_2，較佳的是S或SO_2，甚至更較佳的是S；

R_1係C_1-C_4烷基，較佳的是乙基；

X_{1X}係O或NCH_3；

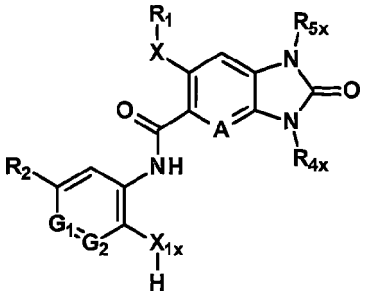
R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基或三氟甲基磺醯基，甚至更較佳的是三氟甲基；

G_1係N或CH；

G_2係N或CH；並且

R_{5y}係C_1-C_6烷基，較佳的是甲基或乙基，甚至更較佳的是甲基。

【0150】 具有式XIx之化合物，



(XIx)，

或其區域異構物、或其異構物混合物（以任何比例）；

其中

A係CH或N，較佳的是CH；

X係S、SO或SO_2，較佳的是S或SO_2，甚至更較佳的是S；

R_1係C_1-C_4烷基，較佳的是乙基；

X_{1X}係O或NCH_3；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基或三氟甲基磺醯基，甚至更較佳的是三氟甲基；

G_1係N或CH；

G_2係N或CH；並且

R_{4x}和R_{5x}彼此獨立地是氫或C_1-C_6烷基，較佳的是氫、甲基或乙基，更較佳的是氫或甲基，甚至更較佳的是甲基。

【0151】 反應物可以在鹼的存在下進行反應。合適的鹼的實例係鹼金屬或鹼土金屬氫氧化物、鹼金屬或鹼土金屬氫化物、鹼金屬或鹼土金屬醯胺、鹼金屬或鹼土金屬醇鹽、鹼金屬或鹼土金屬乙酸鹽、鹼金屬或鹼土金屬碳酸鹽、鹼金屬或鹼土金屬二烷基醯胺或鹼金屬或鹼土金屬烷基矽基醯胺、烷基胺、伸烷基二胺、游離的或N-烷基化的飽和或不飽和的環烷基胺、鹼性雜環、氫氧化銨以及碳環胺。可以提及的實例係氫氧化鈉、氫化鈉、胺基鈉、甲醇鈉、乙酸鈉、碳酸鈉、三級丁醇鉀、氫氧化鉀、碳酸鉀、氫化鉀、二異丙胺基鋰、雙(三甲基矽基)胺基鉀、氫化鈣、三乙胺、二異丙基乙胺、三伸乙基二胺、環己胺、N-環

己基-N,N-二甲胺、N,N-二乙苯胺、吡啶、4-(N,N-二甲胺基)吡啶、喹啶、N-甲基味啉、苄基三甲基氫氧化銨以及1,8-二氮雜二環[5.4.0]十一-7-烯（DBU）。

【0152】 反應物能按照原樣彼此進行反應，即不用添加溶劑或稀釋劑。然而，在大多數情況下，加入惰性溶劑或稀釋劑或該等的混合物係有利的。如果反應在鹼的存在下進行，那麼該等過量使用的鹼（如三乙胺、吡啶、N-甲基味啉或N,N-二乙苯胺）還可以充當溶劑或稀釋劑。

【0153】 反應有利地在從大約-80°C至大約+140°C，較佳的是從大約-30°C至大約+100°C的溫度範圍，在許多情況下在介於環境溫度與大約+80°C之間的範圍下進行。

【0154】 具有式I之化合物能以本身已知的方法轉化為另一種具有式I之化合物，這係藉由以常規方式將具有式I之起始化合物的一個或多個取代基用根據本發明的另一個或其他或多個取代基的替代來實現的。

【0155】 取決於在每種情況下合適的反應條件和起始材料的選擇，有可能的是例如，在一個反應步驟中僅將一個取代基用根據本發明的另一個取代基替代，或者在同一個反應步驟中可以將多個取代基用多個根據本發明的其他取代基來替代。

【0156】 具有式I之化合物的鹽能以本身已知的方式進行製備。因此，例如，具有式I之化合物的酸加成鹽係藉由用合適的酸或合適的離子交換試劑進行處理來獲得的，並且與鹼的鹽係藉由用合適的鹼或用合適的離子交換試劑進行處理來獲得的。

【0157】 具有式I之化合物的鹽能以常規方式轉化成游離的化合物I、酸加成鹽（例如，藉由用合適的鹼性化合物或用合適的離子交換試劑進行處理）以及鹼鹽（例如，藉由用合適的酸或用合適的離子交換試劑進行處理）。

【0158】 具有式I之化合物的鹽能以本身已知的方式轉化成具有式I之化

合物的其他鹽、酸加成鹽，例如轉變成其他酸加成鹽，例如藉由在合適的溶劑中用酸的合適的金屬鹽（如鈉鹽、鋇鹽或銀鹽，例如用乙酸銀）來處理無機酸的鹽（如鹽酸鹽），在該溶劑中，所形成的無機鹽（例如氯化銀）係不溶的並且因此從反應混合物中沈澱出。

【0159】 取決於程序或反應條件，具有成鹽特性的具有式I之化合物能以游離形式或鹽的形式獲得。

【0160】 根據分子中存在的不對稱碳原子的數目、絕對和相對組態和/或根據分子中存在的非芳香族雙鍵的組態，在每種情況下為游離形式或為鹽形式的具有式I之化合物和適當時其互變異構物可以可能的異構物之一的形式或作為其混合物存在，例如以純異構物的形式，如鏡像物和/或非鏡像異構物，或作為異構物混合物，如鏡像異構物混合物，例如外消旋體、非鏡像異構物混合物或外消旋體混合物存在；本發明涉及純異構物以及可能的所有異構物混合物，並且在上下文的每種情況下，甚至在沒有具體提及立體化學細節的每種情況下，都應該從這層意義上來理解。

【0161】 處於游離形式或處於鹽形式的具有式I之化合物的非鏡像異構物混合物或外消旋體混合物（它們的獲得可以取決於已選定的起始材料和程序）能夠在該等組分的物理化學差異的基礎上，例如藉由分步結晶、蒸餾和/或層析法以已知的方式分離成純的非鏡像異構物或外消旋體。

【0162】 能夠以類似方式獲得的鏡像異構物混合物（如外消旋體）可以藉由已知方法拆分成光學鏡像物，例如藉由從光學活性溶劑再結晶；藉由在手性吸附劑上的層析法，例如在乙醯纖維素上的高效液相層析法（HPLC）；借助於合適的微生物，藉由用特異性固定化酶裂解；藉由形成包含化合物，例如使用手性冠醚，其中僅一種鏡像異構物被錯合；或藉由轉化成非鏡像異構鹽，例如藉由使鹼性最終產物外消旋體與光學活性酸（如羧酸例如樟腦酸、酒石酸或蘋

果酸，或磺酸例如樟腦磺酸）反應，並且分離能夠以此方式獲得的非鏡像異構物混合物，例如基於其不同溶解度藉由分步結晶，從而獲得非鏡像異構物，從該等非鏡像異構物可以藉由合適的試劑（例如鹼性試劑）的作用使所希望的鏡像異構物變成游離。

【0163】 純的非鏡像異構物或鏡像異構物能根據本發明來獲得，不僅是藉由分離合適的異構物混合物，還可以是藉由普遍已知的非鏡像選擇性或鏡像選擇性合成的方法，例如藉由利用具有合適的立體化學的起始材料進行根據本發明的方法。

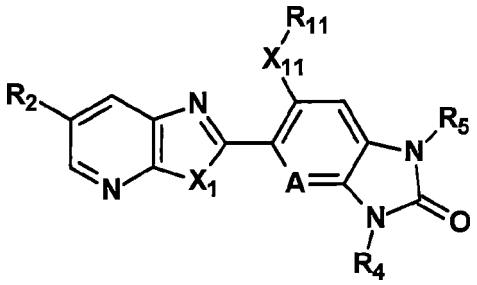
【0164】 可以藉由在酸酐（例如三氟乙酸酐）的存在下使具有式I之化合物與合適的氧化劑（例如H_2O_2/尿素加合物）反應來製備N-氧化物。此類氧化從文獻中已知，例如從J. Med. Chem. [藥物化學雜誌], 32 (12), 2561-73, 1989或WO 00/15615。

【0165】 如果該等單獨的組分具有不同的生物活性，那麼有利的是在每種情況下分離或合成在生物學上更有效的異構物，例如鏡像異構物或非鏡像異構物，或者異構物混合物，例如鏡像異構物混合物或非鏡像異構物混合物。

【0166】 具有式I之化合物和適當時其互變異構物（在每種情況下處於游離形式或處於鹽形式）如果適當的話還能以水合物的形式獲得和/或包括其他溶劑，例如可以用於使以固體形式存在的化合物結晶的那些。

【0167】 根據下表1至12的化合物可以根據上文所述的方法來製備。隨後的該等實例旨在說明本發明並且展示具有式I之較佳的化合物。

表1：此表揭露了具有式I-1a之72種化合物1.001至1.072：



(I-1a)，

其中X_{11}係S，並且A、R_{11}、X_1、R_2、R_4和R_5係如下文所定義的：

〔表1〕：

化合物編號	A	R_{11}	X_1	R_2	R_4	R_5
1.001	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	H	CH_3
1.002	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_3
1.003	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2CH_3	CH_3
1.004	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2CH_3
1.005	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	H	CH_3
1.006	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_3
1.007	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2CH_3	CH_3
1.008	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2CH_3
1.009	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_3	CH_3
1.010	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
1.011	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
1.012	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_3	CH_3
1.013	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
1.014	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
1.015	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_3	CH_3
1.016	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_2CH_3	CH_3
1.017	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_3	CH_2CH_3
1.018	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_3	CH_3
1.019	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_2CH_3	CH_3
1.020	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_3	CH_2CH_3
1.021	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_3	CH_3
1.022	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_2CH_3	CH_3
1.023	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_3	CH_2CH_3
1.024	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_3	CH_3

化合物編號	A	R_{11}	X_1	R_2	R_4	R_5
1.025	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_2CH_3	CH_3
1.026	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_3	CH_2CH_3
1.027	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_3	CH_3
1.028	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
1.029	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
1.030	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_3	CH_3
1.031	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
1.032	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
1.033	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	SO_2-cycloC3	CH_3
1.034	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CN	CH_3
1.035	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2SCH_3	CH_3
1.036	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2SOCH_3	CH_3
1.037	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$CH_2SO_2CH_3$	CH_3
1.038	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2OCH_3	CH_3
1.039	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2CF_3	CH_3
1.040	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CO-cycloC3	CH_3
1.041	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$COOCH_3$	CH_3
1.042	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$COOCH_2CH_3$	CH_3
1.043	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	SO_2-cycloC3
1.044	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CN
1.045	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2SCH_3
1.046	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2SOCH_3
1.047	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$CH_2SO_2CH_3$
1.048	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2OCH_3
1.049	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2CF_3
1.050	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CO-cycloC3
1.051	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$COOCH_3$
1.052	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$COOCH_2CH_3$
1.053	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	SO_2-cycloC3	CH_3
1.054	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CN	CH_3
1.055	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2SCH_3	CH_3
1.056	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2SOCH_3	CH_3
1.057	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$CH_2SO_2CH_3$	CH_3

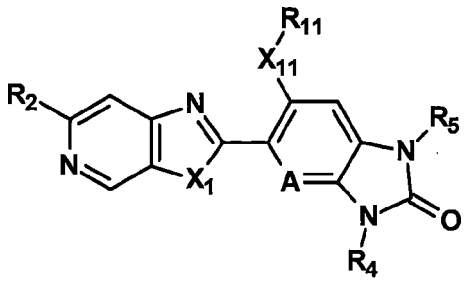
化合物編號	A	R_{11}	X_1	R_2	R_4	R_5
1.058	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2OCH_3	CH_3
1.059	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2CF_3	CH_3
1.060	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CO-cycloC3	CH_3
1.061	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$COOCH_3$	CH_3
1.062	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$COOCH_2CH_3$	CH_3
1.063	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	SO_2-cycloC3
1.064	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CN
1.065	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2SCH_3
1.066	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2SOCH_3
1.067	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$CH_2SO_2CH_3$
1.068	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2OCH_3
1.069	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2CF_3
1.070	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CO-cycloC3
1.071	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$COOCH_3$
1.072	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$COOCH_2CH_3$

以及表1的化合物的N-氧化物。cycloC3表示環丙基基團。

表2：此表揭露了具有式I-1a之72種化合物2.001至2.072，其中X_{11}係SO，並且A、R_{11}、X_1、R_2、R_4和R_5係如在表1中所定義的。

表3：此表揭露了具有式I-1a之72種化合物3.001至3.072，其中X_{11}係SO_2，並且A、R_{11}、X_1、R_2、R_4和R_5係如在表1中所定義的。

表4：此表揭露了具有式I-2a之72種化合物4.001至4.072：



(I-2a)，

其中X_{11}係S，並且A、R_{11}、X_1、R_2、R_4和R_5係如下文所定義的：

〔表4〕：

化合物編號	A	R_{11}	X_1	R_2	R_4	R_5
4.001	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	H	CH_3
4.002	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_3
4.003	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2CH_3	CH_3
4.004	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2CH_3
4.005	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	H	CH_3
4.006	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_3
4.007	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2CH_3	CH_3
4.008	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2CH_3
4.009	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_3	CH_3
4.010	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
4.011	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
4.012	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_3	CH_3
4.013	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
4.014	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
4.015	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_3	CH_3
4.016	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_2CH_3	CH_3
4.017	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_3	CH_2CH_3
4.018	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_3	CH_3
4.019	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_2CH_3	CH_3
4.020	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_3	CH_2CH_3
4.021	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_3	CH_3
4.022	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_2CH_3	CH_3
4.023	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_3	CH_2CH_3
4.024	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_3	CH_3
4.025	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_2CH_3	CH_3
4.026	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_3	CH_2CH_3
4.027	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_3	CH_3
4.028	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
4.029	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
4.030	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_3	CH_3
4.031	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
4.032	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
4.033	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	SO_2-cycloC3	CH_3

化合物編號	A	R_{11}	X_1	R_2	R_4	R_5
4.034	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CN	CH_3
4.035	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2SCH_3	CH_3
4.036	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2SOCH_3	CH_3
4.037	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$CH_2SO_2CH_3$	CH_3
4.038	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2OCH_3	CH_3
4.039	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2CF_3	CH_3
4.040	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CO-cycloC3	CH_3
4.041	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$COOCH_3$	CH_3
4.042	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$COOCH_2CH_3$	CH_3
4.043	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	SO_2-cycloC3
4.044	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CN
4.045	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2SCH_3
4.046	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2SOCH_3
4.047	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$CH_2SO_2CH_3$
4.048	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2OCH_3
4.049	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2CF_3
4.050	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CO-cycloC3
4.051	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$COOCH_3$
4.052	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$COOCH_2CH_3$
4.053	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	SO_2-cycloC3	CH_3
4.054	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CN	CH_3
4.055	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2SCH_3	CH_3
4.056	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2SOCH_3	CH_3
4.057	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$CH_2SO_2CH_3$	CH_3
4.058	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2OCH_3	CH_3
4.059	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2CF_3	CH_3
4.060	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CO-cycloC3	CH_3
4.061	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$COOCH_3$	CH_3
4.062	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$COOCH_2CH_3$	CH_3
4.063	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	SO_2-cycloC3
4.064	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CN
4.065	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2SCH_3
4.066	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2SOCH_3

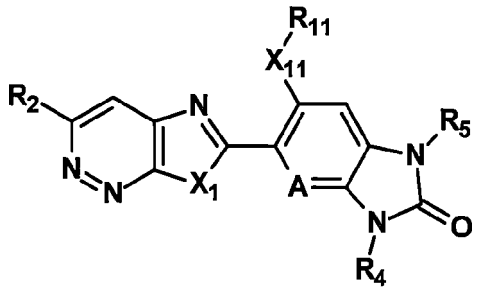
化合物編號	A	R_{11}	X_1	R_2	R_4	R_5
4.067	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$CH_2SO_2CH_3$
4.068	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2OCH_3
4.069	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2CF_3
4.070	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CO-cycloC3
4.071	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$COOCH_3$
4.072	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$COOCH_2CH_3$

以及表4的化合物的N-氧化物。cycloC3表示環丙基基團。

表5：此表揭露了具有式I-2a之72種化合物5.001至5.072，其中X_{11}係SO，並且A、R_{11}、X_1、R_2、R_4和R_5係如在表4中所定義的。

表6：此表揭露了具有式I-2a之72種化合物6.001至6.072，其中X_{11}係SO_2，並且A、R_{11}、X_1、R_2、R_4和R_5係如在表4中所定義的。

表7：此表揭露了具有式I-3a之72種化合物7.001至7.072：



(I-3a)，

其中X_{11}係S，並且A、R_{11}、X_1、R_2、R_4和R_5係如下文所定義的：

〔表7〕：

化合物編號	A	R_{11}	X_1	R_2	R_4	R_5
7.001	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	H	CH_3
7.002	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_3
7.003	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2CH_3	CH_3
7.004	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2CH_3
7.005	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	H	CH_3
7.006	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_3
7.007	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2CH_3	CH_3
7.008	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2CH_3

化合物編號	A	R_{11}	X_1	R_2	R_4	R_5
7.009	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_3	CH_3
7.010	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
7.011	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
7.012	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_3	CH_3
7.013	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
7.014	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
7.015	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_3	CH_3
7.016	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_2CH_3	CH_3
7.017	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_3	CH_2CH_3
7.018	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_3	CH_3
7.019	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_2CH_3	CH_3
7.020	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_3	CH_2CH_3
7.021	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_3	CH_3
7.022	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_2CH_3	CH_3
7.023	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_3	CH_2CH_3
7.024	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_3	CH_3
7.025	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_2CH_3	CH_3
7.026	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_3	CH_2CH_3
7.027	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_3	CH_3
7.028	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
7.029	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
7.030	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_3	CH_3
7.031	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
7.032	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
7.033	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	SO_2-cycloC3	CH_3
7.034	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CN	CH_3
7.035	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2SCH_3	CH_3
7.036	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2SOCH_3	CH_3
7.037	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$CH_2SO_2CH_3$	CH_3
7.038	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2OCH_3	CH_3
7.039	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2CF_3	CH_3
7.040	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CO-cycloC3	CH_3
7.041	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$COOCH_3$	CH_3

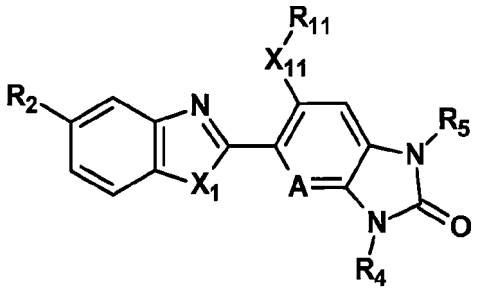
化合物編號	A	R_{11}	X_1	R_2	R_4	R_5
7.042	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$COOCH_2CH_3$	CH_3
7.043	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	SO_2-cycloC3
7.044	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CN
7.045	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2SCH_3
7.046	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2SOCH_3
7.047	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$CH_2SO_2CH_3$
7.048	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2OCH_3
7.049	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2CF_3
7.050	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CO-cycloC3
7.051	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$COOCH_3$
7.052	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$COOCH_2CH_3$
7.053	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	SO_2-cycloC3	CH_3
7.054	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CN	CH_3
7.055	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2SCH_3	CH_3
7.056	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2SOCH_3	CH_3
7.057	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$CH_2SO_2CH_3$	CH_3
7.058	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2OCH_3	CH_3
7.059	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2CF_3	CH_3
7.060	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CO-cycloC3	CH_3
7.061	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$COOCH_3$	CH_3
7.062	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$COOCH_2CH_3$	CH_3
7.063	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	SO_2-cycloC3
7.064	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CN
7.065	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2SCH_3
7.066	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2SOCH_3
7.067	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$CH_2SO_2CH_3$
7.068	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2OCH_3
7.069	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2CF_3
7.070	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CO-cycloC3
7.071	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$COOCH_3$
7.072	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$COOCH_2CH_3$

以及表7的化合物的N-氧化物。cycloC3表示環丙基基團。

表8：此表揭露了具有式I-3a之72種化合物8.001至8.072，其中X_{11}係SO，並且A、R_{11}、X_1、R_2、R_4和R_5係如在表7中所定義的。

表9：此表揭露了具有式I-3a之72種化合物9.001至9.072，其中X_{11}係SO_2，並且A、R_{11}、X_1、R_2、R_4和R_5係如在表7中所定義的。

表10：此表揭露了具有式I-4a之140種化合物10.001至10.140：



(I-4a)，

其中X_{11}係S，並且A、R_{11}、X_1、R_2、R_4和R_5係如下文所定義的：

〔表10〕：

化合物編號	A	R_{11}	X_1	R_2	R_4	R_5
10.001	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	CH_3
10.002	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_2CH_3	CH_3
10.003	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	CH_2CH_3
10.004	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	CH_3
10.005	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_2CH_3	CH_3
10.006	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	CH_2CH_3
10.007	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_2CF_3	CH_3	CH_3
10.008	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
10.009	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
10.010	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_2CF_3	CH_3	CH_3
10.011	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
10.012	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
10.013	N	$-CH_2CH_3$	O	SCF_3	CH_3	CH_3
10.014	N	$-CH_2CH_3$	O	SCF_3	CH_2CH_3	CH_3
10.015	N	$-CH_2CH_3$	O	SCF_3	CH_3	CH_2CH_3

化合物編號	A	R_{11}	X_1	R_2	R_4	R_5
10.016	CH	$-CH_2CH_3$	O	SCF_3	CH_3	CH_3
10.017	CH	$-CH_2CH_3$	O	SCF_3	CH_2CH_3	CH_3
10.018	CH	$-CH_2CH_3$	O	SCF_3	CH_3	CH_2CH_3
10.019	N	$-CH_2CH_3$	O	$SOCF_3$	CH_3	CH_3
10.020	N	$-CH_2CH_3$	O	$SOCF_3$	CH_2CH_3	CH_3
10.021	N	$-CH_2CH_3$	O	$SOCF_3$	CH_3	CH_2CH_3
10.022	CH	$-CH_2CH_3$	O	$SOCF_3$	CH_3	CH_3
10.023	CH	$-CH_2CH_3$	O	$SOCF_3$	CH_2CH_3	CH_3
10.024	CH	$-CH_2CH_3$	O	$SOCF_3$	CH_3	CH_2CH_3
10.025	N	$-CH_2CH_3$	O	SO_2CF_3	CH_3	CH_3
10.026	N	$-CH_2CH_3$	O	SO_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
10.027	N	$-CH_2CH_3$	O	SO_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
10.028	CH	$-CH_2CH_3$	O	SO_2CF_3	CH_3	CH_3
10.029	CH	$-CH_2CH_3$	O	SO_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
10.030	CH	$-CH_2CH_3$	O	SO_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
10.031	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	SO_2-cycloC3	CH_3
10.032	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CN	CH_3
10.033	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_2SCH_3	CH_3
10.034	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_2SOCH_3	CH_3
10.035	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	$CH_2SO_2CH_3$	CH_3
10.036	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_2OCH_3	CH_3
10.037	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_2CF_3	CH_3
10.038	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CO-cycloC3	CH_3
10.039	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	$COOCH_3$	CH_3
10.040	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	$COOCH_2CH_3$	CH_3
10.041	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	SO_2-cycloC3
10.042	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	CN
10.043	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	CH_2SCH_3
10.044	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	CH_2SOCH_3
10.045	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	$CH_2SO_2CH_3$
10.046	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	CH_2OCH_3
10.047	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	CH_2CF_3
10.048	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	CO-cycloC3

化合物編號	A	R_{11}	X_1	R_2	R_4	R_5
10.049	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	$COOCH_3$
10.050	N	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	$COOCH_2CH_3$
10.051	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	SO_2-cycloC3	CH_3
10.052	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CN	CH_3
10.053	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_2SCH_3	CH_3
10.054	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_2SOCH_3	CH_3
10.055	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	$CH_2SO_2CH_3$	CH_3
10.056	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_2OCH_3	CH_3
10.057	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_2CF_3	CH_3
10.058	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CO-cycloC3	CH_3
10.059	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	$COOCH_3$	CH_3
10.060	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	$COOCH_2CH_3$	CH_3
10.061	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	SO_2-cycloC3
10.062	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	CN
10.063	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	CH_2SCH_3
10.064	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	CH_2SOCH_3
10.065	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	$CH_2SO_2CH_3$
10.066	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	CH_2OCH_3
10.067	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	CH_2CF_3
10.068	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	CO-cycloC3
10.069	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	$COOCH_3$
10.070	CH	$-CH_2CH_3$	O	CF_3	CH_3	$COOCH_2CH_3$
10.071	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_3
10.072	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2CH_3	CH_3
10.073	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2CH_3
10.074	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_3
10.075	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2CH_3	CH_3
10.076	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2CH_3
10.077	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_3	CH_3
10.078	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
10.079	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
10.080	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_3	CH_3
10.081	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3

化合物編號	A	R_{11}	X_1	R_2	R_4	R_5
10.082	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
10.083	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_3	CH_3
10.084	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_2CH_3	CH_3
10.085	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_3	CH_2CH_3
10.086	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_3	CH_3
10.087	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_2CH_3	CH_3
10.088	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SCF_3	CH_3	CH_2CH_3
10.089	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_3	CH_3
10.090	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_2CH_3	CH_3
10.091	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_3	CH_2CH_3
10.092	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_3	CH_3
10.093	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_2CH_3	CH_3
10.094	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	$SOCF_3$	CH_3	CH_2CH_3
10.095	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_3	CH_3
10.096	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
10.097	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
10.098	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_3	CH_3
10.099	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_2CH_3	CH_3
10.100	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	SO_2CF_3	CH_3	CH_2CH_3
10.101	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	SO_2-cycloC3	CH_3
10.102	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CN	CH_3
10.103	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2SCH_3	CH_3
10.104	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2SOCH_3	CH_3
10.105	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$CH_2SO_2CH_3$	CH_3
10.106	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2OCH_3	CH_3
10.107	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2CF_3	CH_3
10.108	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CO-cycloC3	CH_3
10.109	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$COOCH_3$	CH_3
10.110	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$COOCH_2CH_3$	CH_3
10.111	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	SO_2-cycloC3
10.112	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CN
10.113	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2SCH_3
10.114	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2SOCH_3

化合物編號	A	R_{11}	X_1	R_2	R_4	R_5
10.115	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$CH_2SO_2CH_3$
10.116	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2OCH_3
10.117	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2CF_3
10.118	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CO-cycloC3
10.119	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$COOCH_3$
10.120	N	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$COOCH_2CH_3$
10.121	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	SO_2-cycloC3	CH_3
10.122	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CN	CH_3
10.123	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2SCH_3	CH_3
10.124	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2SOCH_3	CH_3
10.125	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$CH_2SO_2CH_3$	CH_3
10.126	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2OCH_3	CH_3
10.127	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_2CF_3	CH_3
10.128	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CO-cycloC3	CH_3
10.129	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$COOCH_3$	CH_3
10.130	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	$COOCH_2CH_3$	CH_3
10.131	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	SO_2-cycloC3
10.132	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CN
10.133	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2SCH_3
10.134	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2SOCH_3
10.135	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$CH_2SO_2CH_3$
10.136	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2OCH_3
10.137	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CH_2CF_3
10.138	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	CO-cycloC3
10.139	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$COOCH_3$
10.140	CH	$-CH_2CH_3$	NCH_3	CF_3	CH_3	$COOCH_2CH_3$

以及表10的化合物的N-氧化物。cycloC3表示環丙基基團。

表11：此表揭露了具有式I-4a之140種化合物11.001至11.140，其中X_{11}係SO，並且A、R_{11}、X_1、R_2、R_4和R_5係如在表10中所定義的。

表12：此表揭露了具有式I-4a之140種化合物12.001至12.140，其中X_{11}係SO_2，並且A、R_{11}、X_1、R_2、R_4和R_5係如在表10中所定義的。

【0168】 根據本發明的具有式I之化合物可以具有任何數量的益處，尤其包括針對保護植物對抗昆蟲的有利水平的生物活性或對於用作農用化學品活性成分的優越特性（例如，更高的生物活性、有利的活性範圍、增加的安全性、改進的物理-化學特性、或增加的生物可降解性）。具體而言，現在已經出人意料地發現某些具有式 (I) 之化合物相對於非靶標節肢動物特別是傳粉者（如蜜蜂、獨居蜂和熊蜂）可以顯示出有利的安全性。最特別地，相對於義大利蜂（Apis mellifera）。

【0169】 具體而言，根據本發明的具有式I之化合物在有害生物控制領域中是有預防和/或治療價值的活性成分，即使是在低的施用量下，它們具有非常有利的殺生物譜並且是溫血物種、魚以及植物良好耐受的。根據本發明的活性成分作用於正常敏感的以及還有抗藥的動物有害生物（如昆蟲或蜱螨目的代表）的所有的或個別的發育階段。根據本發明的活性成分的殺昆蟲或殺螨活性可以本身直接顯示，即立即或僅在過去一些時間之後（例如在蛻皮期間）發生破壞有害生物；或間接顯示，例如降低產卵和/或孵化率，對應於至少50%至60%的破壞率（死亡率）的良好活性。

【0170】 上述動物有害生物的實例係：

【0171】 來自蜱螨目，例如

下毛癭螨屬（Acalitus spp.）、針刺癭螨屬（Aculus spp）、窄癭螨屬（Acaricalus spp.）、瘤癭螨屬（Aceria spp.）、粗腳粉螨（Acarus siro）、鈍眼蜱屬（Amblyomma spp.）、銳緣蜱屬（Argas spp.）、牛蜱屬（Boophilus spp.）、短須螨屬（Brevipalpus spp.）、薹螨屬（Bryobia spp）、上三節癭螨屬（Calipitrimerus spp.）、皮螨屬（Chorioptes spp.）、雞皮刺螨（Dermanyssus gallinae）、表皮螨屬（Dermatophagoides spp）、始葉螨屬（Eotetranychus spp）、癭螨屬（Eriophyes spp.）、半跗線螨屬（Hemitarsonemus spp）、璃眼蜱屬（Hyalomma spp.）、硬

蜱屬（Ixodes spp.）、小爪螨屬（Olygonychus spp）、鈍緣蜱屬（Ornithodoros spp.）、側多食跗線螨（Polyphagotarsone latus）、全爪螨屬（Panonychus spp.）、桔藝鏽螨（Phyllocoptruta oleivora）、植食螨（Phytonemus spp.）、跗線螨屬（Polyphagotarsonemus spp）、癢螨屬（Psoroptes spp.）、扇頭蜱屬（Rhipicephalus spp.）、根嗜螨屬（Rhizoglyphus spp.）、疥螨屬（Sarcoptes spp.）、狹跗線螨屬（Steneotarsonemus spp）、跗線屬（Tarsonemus spp.）以及葉螨屬（Tetranychus spp.）；

【0172】 來自虱目，例如

血虱屬（*Haematopinus spp.*）、長顎虱屬（*Linognathus spp.*）、人虱（*Pediculus spp.*）、天蛞瘡屬（*Pemphigus spp.*）以及木虱（*Phylloxera spp.*）；

【0173】 來自鞘翅目，例如

缺隆叩甲屬（*Agriotes spp.*）、歐洲鰓角金龜（*Amphimallon majale*）、東方異麗金龜（*Anomala orientalis*）、花象屬（*Anthonomus spp.*）、蜉金龜屬（*Aphodius spp*）、玉米擬花螢（*Astylus atromaculatus*）、*Ataenius*屬、甜菜隱食甲（*Atomaria linearis*）、甜菜脛跳甲（*Chaetocnema tibialis*）、螢葉甲屬（*Cerotoma spp*）、單葉叩甲屬（*Conoderus spp*）、根頸象屬（*Cosmopolites spp.*）、綠金龜（*Cotinisnitida*）、象蟲屬（*Curculio spp.*）、圓頭犀金龜屬（*Cyclocephala spp*）、圓頭犀金龜屬（*Dermestes spp.*）、根螢葉甲屬（*Diabrotica spp.*）、阿根廷兜蟲（*Diloboderus abderus*）、食植瓢蟲屬（*Epilachna spp.*）、*Eremnus*屬、黑異爪蔗金龜（*Heteronychus arator*）、咖啡果小蠹（*Hypothenemus hampei*）、*Lagria vilosa*、馬鈴薯甲蟲（*Leptinotarsa decemLineata*）、稻水象屬（*Lissorhoptrus spp.*）、*Liogenys*屬、*Maecolaspis*屬、栗色絨金龜（*Maladera castanea*）、美洲葉甲亞種（*Megascelis spp*）、油菜花露尾甲（*Melighetes aeneus*）、金龜屬（*Melolontha spp.*）、*Myochrous armatus*、鋸穀盜屬（*Orycaephilus spp.*）、耳喙象屬（*Otiorhynchus*

spp.）、鰓角金龜屬（*Phyllophaga spp.*）、斑象屬（*Phlyctinus spp.*）、麗金龜屬（*Popillia spp.*）、油菜跳甲屬（*Psylliodes spp.*）、*Rhyssomatus aubtilis*、劫根蟲屬（*Rhizopertha spp.*）、金龜子科（*Scarabeidae*）、米象屬（*Sitophilus spp.*）、麥蛾屬（*Sitotroga spp.*）、偽切根蟲屬（*Somaticus spp.*）、*Sphenophorus*屬、大豆莖象(*Sternechus subsignatus*)、擬步行蟲屬(*Tenebrio spp.*)、擬穀盜屬(*Tribolium spp.*）以及斑皮蟲屬（*Trogoderma spp.*）；

【0174】 來自雙翅目，例如

伊蚊屬（Aedes spp.）、瘧蚊屬（Anopheles spp）、高梁芒蠅（Antherigona soccata.）、橄欖果實蠅（Bactrocea oleae）、花園毛蚊（Bibio hortulanus）、遲眼蕈蚊屬（Bradysia spp.）、紅頭麗蠅（Calliphora erythrocephala）、小條實蠅屬（Ceratitis spp.）、金蠅屬（Chrysomyia spp.）、庫蚊屬（Culex spp.）、黃蠅屬（Cuterebra spp.）、寡鬃實蠅屬（Dacus spp.）、地種蠅屬（Delia spp）、黑腹果蠅（Drosophilamelanogaster）、廁蠅屬（Fannia spp.）、胃蠅屬（Gastrophilus spp.）、Geomyza tripunctata、舌蠅屬(Glossina spp.)、皮蠅屬(Hypoderma spp.)、虱蠅屬(Hyppobosca spp.)、斑潛蠅屬(Liriomyza spp.)、綠蠅屬(Lucilia spp.)、潛蠅屬(Melanagromyza spp.)、家蠅屬(Musca spp.)、狂蠅屬(Oestrus spp.)、癭蚊屬（Orseolia spp.）、瑞典麥稈蠅（Oscinella frit）、藜泉蠅（Pegomyia hyoscyami）、草種蠅屬（Phorbia spp.）、繞實蠅屬（Rhagoletis spp）、Rivelia quadrifasciata、Scatella屬、蕈蚊屬（Sciara spp.）、刺蠅屬（Stomoxys spp.）、虻屬（Tabanus spp.）、絛蟲屬（Tannia spp.）以及大蚊屬（Tipula spp.）；

【0175】 來自半翅目（*Hemiptera*），例如

瘤緣蝽（Acanthocoris scabrator）、綠蝽屬、苜蓿盲蝽、Amblypeltanitida、海蝦盾緣蝽（Bathycoelia thalassina）、土長蝽屬、臭蟲屬、Clavigralla tomentosicollis、盲蝽屬（Creontiades spp.）、可可瘤盲蝽、Dichelops furcatus、

棉紅蝽屬、Edessa屬、美洲蝽屬（Euchistus spp.）、六斑菜蝽（Eurydema pulchrum）、扁盾蝽屬、茶翅蝽、具凹巨股長蝽（Horciasnobilellus）、稻緣蝽屬、草盲蝽屬、熱帶碩蚧屬、捲心菜斑色蝽（Murgantia histrionic）、Neomegalotomus屬、煙盲蝽（Nesidiocoris tenuis）、綠蝽屬、擬長蝽（Nysius simulans）、Oebalus insularis、皮蝽屬、壁蝽屬、紅獵蝽屬、可可盲蝽象、Scaptocoris castanea、黑蝽屬（Scotinophara spp.）、Thyanta屬、錐鼻蟲屬、木薯網蝽（Vatiga illudens）；

【0176】 無網長管蚜屬、Adalges spp.、Agalliana ensigera、Agonoscena targionii、粉虱屬（Aleurodicus spp.）、Aleurocanthus spp.、甘蔗穴粉虱、軟毛粉虱（Aleurothrixus floccosus）、甘藍粉虱（Aleyrodes brassicae）、棉葉蟬（Amarasca biguttula）、Amritodus atkinson、腎圓盾蚧屬、蚜科、蚜屬、蚧屬（Aspidiotus spp.）、茄溝無網蚜、Bactericera cockerelli、小粉虱屬、Brachycaudus spp.、甘藍蚜、喀木虱屬、雙尾蚜（Cavariella aegopodii Scop.）、蠟蚧屬、褐圓蚧、網籽草葉圓蚧、Cicadella spp.、大白葉蟬（Cofana spectra）、隱瘤蚜屬、Cicadulina spp.、褐軟蚧、玉米黃翅葉蟬、裸粉虱屬、柑橘木虱、麥雙尾蚜、西圓尾蚜屬、小綠葉蟬屬、蘋果綿蚜、葡萄斑葉蟬屬、蠟蛤屬、赤桉木虱（Glycaspis brimblecombei）、菜縊管蚜、Hyalopterus spp.、超瘤蚜種、檬果綠葉蟬（Idioscopus clypealis）、Jacobiasca lybica、灰飛虱屬、球堅蚧、蠣盾蚧屬、蘿蔔蚜（Lopaphis erysimi）、Lyogenys maidis、長管蚜屬、Mahanarva spp.、蛾蠟蟬科（Metcalfa pruinosa）、麥無網蚜、Myndus crudus、瘤蚜屬、臺灣韭蚜、黑尾葉蟬屬、褐飛虱屬（Nilaparvata spp.）、梨大綠蚜、Odonaspis ruthae、寄生甘蔗綿蚜、楊梅緣粉虱、考氏木虱、片盾蚧屬、癭綿蚜屬、玉米蠟蟬、扁角飛虱屬、忽布疣蚜、根瘤蚜屬、動性球菌屬、白盾蚧屬、粉蚧屬、棉盲蝽（Pseudatomoscelis seriatus）、木虱屬、棉蚧（Pulvinaria aethiopica）、笠圓盾蚧屬、Quesada gigas、電光葉蟬（Recilia dorsalis）、縊管蚜屬、黑盔蚧屬、帶葉蟬屬、二叉蚜屬、麥蚜屬（Sitobion spp.）、白背飛虱、

Spissistilus festinus、條斑飛虱(Tarophagus Proserpina)、聲蚜屬、粉虱屬、Tridiscus sporoboli、葵粉蚧屬(Trionymus spp.)、非洲木虱、桔矢尖蚧、Zygina flammigera、Zyginidia scutellaris；

【0177】 來自膜翅目，例如

頂切葉蟻屬(Acromyrmex)、三節葉蜂屬(Arge spp.)、布切葉白蟻屬(Atta spp.)、莖葉蜂屬(Cephus spp.)、松葉蜂屬(Diprion spp.)、鋸角葉蜂科(Diprionidae)、松葉蜂(Gilpinia polytoma)、梨實蜂屬(Hoplocampa spp.)、毛蟻屬(Lasius spp.)、小黃家蟻(Monomorium pharaonis)、新松葉蜂屬(Neodiprion spp.)、農蟻屬(Pogonomyrmex spp)、Slenopsis invicta、水蟻屬(Solenopsis spp.)以及胡蜂屬(Vespa spp.)；

【0178】 來自等翅目，例如

家白蟻屬、白蟻(Corniternes cumulans)、楹白蟻屬(Incisitermes spp)、大白蟻屬(Macrotermes spp)、澳白蟻屬(Mastotermes spp)、小白蟻屬(Microtermes spp)、散白蟻屬(Reticulitermes spp.)；熱帶火蟻(Solenopsis geminate)

【0179】 來自鱗翅目，例如

長翅卷蛾屬、褐帶卷蛾屬、透翅蛾屬、地夜蛾屬、棉葉蟲、Amylois spp.、黎豆夜蛾、黃卷蛾屬、銀蛾屬(Argyresthia spp.)、帶卷蛾屬、丫紋夜蛾屬、棉潛蛾、玉米楷夜蛾、粉斑螟蛾、桃蛀果蛾、禾草螟屬、卷葉蛾屬、越蔓桔草螟(Chrysoteuchia topiaria)、葡萄果蠹蛾、卷葉螟屬、雲卷蛾屬、紋卷蛾屬、鞘蛾屬、磷翅目粉蝶、Cosmophila flava、草螟屬、大菜螟、蘋果異形小卷蛾、黃楊木蛾、小卷蛾屬、黃楊絹野螟、桿草螟屬、蘇丹棉鈴蟲、金剛鑽屬、非洲莖螟、粉螟屬、葉小卷蛾屬(Epinotia spp)、細斑燈蛾、Etiella zinckinella、花小卷蛾屬、環針單紋蛾、黃毒蛾屬、切根蟲屬、Feltia jaculiferia、Grapholita spp.、綠青蟲蛾、實夜蛾屬、菜螟、切葉野螟屬(Herpetogramma spp)、美國白蛾、

番茄蠹蛾、Lasmopalpus lignosellus、旋紋潛葉蛾、潛葉細蛾屬、葡萄花翅小卷蛾、Loxostege bifidalis、毒蛾屬、潛蛾屬、幕枯葉蛾屬、甘藍夜蛾、菸草天蛾、Mythimna spp、夜蛾屬、秋尺蛾屬、Orniodes indica、歐洲玉米螟、超小卷蛾屬、褐卷蛾屬、小眼夜蛾、蛀莖夜蛾、Pectinophora gossypi-ela、咖啡潛葉蛾、一星黏蟲、馬鈴薯麥蛾、菜粉蝶、粉蝶屬、小菜蛾、芽蛾屬、尺葉蛾屬、薄荷灰夜蛾、西方豆地香（Richia albicosta）、白禾螟屬（Scirpophaga spp.）、蛀莖夜蛾屬、長須卷蛾屬、灰翅夜蛾屬、棉大卷葉螟、興透翅蛾屬、異舟蛾屬、卷葉蛾屬、粉紋夜蛾、番茄斑潛蠅、以及巢蛾屬；

【0180】 來自食毛目，例如

畜虱屬（*Damalinea spp.*）和齧毛虱屬（*Trichodectes spp.*）；

【0181】 來自直翅目，例如

蠊屬、小蠊屬、螻蛄屬、馬德拉蜚蠊、飛蝗屬、北痣蟋蟀（*Neocurtilla hexadactyla*）、大蠊屬、痣蟋蟀屬（*Scapteriscus spp.*）、以及沙漠蝗屬；

【0182】 來自齧蟲目，例如

虱齧屬（*Liposcelis* spp.）；

【0183】 來自蚤目，例如

角葉蚤屬（*Ceratophyllus spp.*）、櫛頭蚤屬（*Ctenocephalides spp.*）以及開皇客蚤（*Xenopsylla cheopis*）；

【0184】 來自纓翅目，例如

Calliothrips phaseoli、花薊馬屬、陽薊馬屬、褐帶薊馬屬、單親薊馬屬（*Parthenothrips spp.*）、非洲桔硬薊馬（*Scirtothrips aurantii*）、大豆薊馬（*Sericothrips variabilis*）、帶薊馬屬、薊馬屬；

【0185】 來自纓尾目，例如衣魚（Lepisma saccharina）。

【0186】 根據本發明的活性成分可用於控制、也就是遏制或破壞上述類型

的有害生物，該等有害生物特別出現在植物上，尤其是在農業中、在園藝中以及在林業中的有用的植物和觀賞植物上，或者在該等植物的器官上，例如果實、花、葉、莖、塊莖或根，並且在一些情況下，甚至在隨後的時間點形成的植物器官仍保持受保護抵抗該等有害生物。

【0187】 適宜的目標作物具體是，穀物，如小麥、大麥、黑麥、燕麥、稻、玉米或高粱；甜菜，如糖用甜菜或飼料甜菜；水果，例如梨果、核果或無核小果，如蘋果、梨、李子、桃、杏、櫻桃或漿果，例如草莓、覆盆子或黑莓；豆科作物，如菜豆、小扁豆、豌豆或大豆；油料作物，如油菜、芥菜、罌粟、橄欖、向日葵、椰子、蓖麻、可可豆或花生；瓜類作物，如南瓜、黃瓜或甜瓜；纖維植物，如棉花、亞麻、大麻或黃麻；柑橘類水果，如橙、檸檬、葡萄柚或橘子；蔬菜，如菠菜、萵苣、蘆筍、捲心菜、胡蘿蔔、洋蔥、番茄、馬鈴薯或燈籠椒；樟科，如鱷梨、肉桂或樟腦；以及還有菸草、堅果、咖啡、茄子、甘蔗、茶、辣椒、葡萄藤、蛇麻草、車前草科以及乳膠植物。

【0188】 本發明的組成物和/或方法還可以用在任何觀賞植物和/或蔬菜作物（包括花、灌木、闊葉樹和常綠植物）上。

【0189】 例如，本發明可以用在任何以下觀賞植物物種上：藿香薊屬、假面花屬（*Alonsoa* spp.）、銀蓮花屬、南非葵、春黃菊屬、金魚草屬、紫菀屬、秋海棠屬（例如麗格海棠、四季秋海棠、球根秋海棠（*B. tubéreux*））、葉子花屬、雁河菊屬（*Brachycome* spp.）、蕓薹屬（觀賞植物）、蒲包草屬、辣椒、長春花、美人蕉屬、矢車菊屬、菊屬、瓜葉菊屬（銀葉菊）、金雞菊屬、青鎖龍（*Crassula coccinea*）、火紅萼距花（*Cuphea ignea*）、大麗花屬、翠雀屬、荷包牡丹、彩虹菊屬（*Dorotheantus* spp.）、洋桔梗、連翹屬、倒掛金鐘屬、鼠曲草老鸛草（*Geranium gnaphalium*）、大丁草屬、千日紅、天芥菜屬、向日葵屬、木槿屬、繡球花屬、繡球屬、嫣紅蔓、鳳仙花屬（非洲鳳仙花）、血莧屬（*Iresines*

spp.）、伽藍菜屬、馬纓丹、三月花葵、獅耳花、百合屬、日中花屬、溝酸漿屬、美國薄荷屬、龍面花屬、萬壽菊屬、石竹屬（康乃馨）、美人蕉屬、酢漿草屬、雛菊屬、天竺葵屬（盾葉天竺葵、馬蹄紋天竺葵）、堇菜屬（三色堇）、碧冬茄屬、草夾竹桃屬、香茶菜屬（*Plecthranthus* spp.）、一品紅屬、爬山虎屬（五葉爬山虎、爬山虎）、報春花屬、毛茛屬、杜鵑花屬、薔薇屬（玫瑰）、黃雛菊屬、非洲堇屬、鼠尾草屬、紫扇花（*Scaevola aemola*）、蛾蝶花（*Schizanthus wisetonensis*）、景天屬、茄屬、蘇非尼亞矮牽牛屬（*Surfinia* spp.）、萬壽菊屬、菸草屬、馬鞭草屬、百日草屬以及其他花壇植物。

【0190】 例如，本發明可以用於任何以下蔬菜物種：蔥屬（大蒜、洋蔥、火蔥（*A. oschaninii*）、韭蔥、小蔥、大蔥）、有喙歐芹、旱芹、蘆筍、甜菜、蕓薹屬（甘藍、大白菜、蕪菁）、辣椒、鷹嘴豆、苦苣、菊苣屬（菊苣、苦苣）、西瓜、黃瓜屬（黃瓜、甜瓜）、南瓜屬（西葫蘆、印度南瓜）、菜薊屬（朝鮮薊、刺苞菜薊）、胡蘿蔔、茴香、金絲桃屬、萵苣、番茄屬（番茄、櫻桃番茄）、薄荷屬、羅勒、香芹、菜豆屬（菜豆、荷包豆）、豌豆、蘿蔔、食用大黃、迷迭香屬、鼠尾草屬、黑婆羅門參、茄子、菠菜、新緬草屬（萵苣緬草、*V. eriocarpa*）以及蠶豆。

【0191】 較佳的觀賞植物物種包括非洲堇、秋海棠屬、大麗花屬、大丁草屬、繡球屬、馬鞭草屬、薔薇屬、伽藍菜屬、一品紅屬、紫菀屬、矢車菊屬、金雞菊屬、翠雀屬、美國薄荷屬、草夾竹桃屬、黃雛菊屬、景天屬、碧冬茄屬、堇菜屬、鳳仙花屬、老鸛草屬、菊屬、毛茛屬、倒掛金鐘屬、鼠尾草屬、繡球花屬、迷迭香、鼠尾草、聖約翰草、薄荷、甜椒、番茄和黃瓜。

【0192】 根據本發明所述的活性成分尤其適合於控制棉花、蔬菜、玉米、水稻以及大豆作物上的豆蚜、黃瓜條葉甲（Diabrotica balteata）、煙芽夜蛾（Heliothis virescens）、桃蚜、小菜蛾以及海灰翅夜蛾（Spodoptera littoralis）。

根據本發明的該等活性成分另外尤其適合於控制甘藍夜蛾（較佳的是在蔬菜上）、蘋果蠹蛾（較佳的是在蘋果上）、小綠葉蟬（Empoasca）（較佳的是在蔬菜、葡萄園裡）、馬鈴薯葉甲（Leptinotarsa）（較佳的是在馬鈴薯上）以及二化螟（較佳的是在水稻上）。

【0193】 根據本發明所述的活性成分尤其適合於控制棉花、蔬菜、玉米、水稻以及大豆作物上的豆蚜、黃瓜條葉甲、煙芽夜蛾、桃蚜、小菜蛾以及海灰翅夜蛾。根據本發明的該等活性成分另外尤其適合於控制甘藍夜蛾（較佳的是在蔬菜上）、蘋果蠹蛾（較佳的是在蘋果上）、小綠葉蟬（較佳的是在蔬菜、葡萄園裡）、馬鈴薯葉甲（較佳的是在馬鈴薯上）以及二化螟（較佳的是在水稻上）。

【0194】 在另一個方面，本發明還可以涉及控制由植物寄生的線蟲（內寄生的-、半內寄生的-以及外寄生的線蟲）對植物或其部分引起損害之方法，尤其是以下植物寄生的線蟲，如根結線蟲（root knot nematodes）、北方根結線蟲（*Meloidogyne hapla*）、南方根結線蟲（*Meloidogyne incognita*）、爪哇根結線蟲（*Meloidogyne javanica*）、花生根結線蟲（*Meloidogyne arenaria*）以及其他根結線蟲屬種類（*Meloidogyne species*）；孢囊形成線蟲（cyst-forming nematodes）、馬鈴薯金線蟲（*Globodera rostochiensis*）以及其他球孢囊線蟲屬種類（Globodera species）；禾穀孢囊線蟲（*Heterodera avenae*）、大豆胞囊線蟲（Heterodera *glycines*）、甜菜胞囊線蟲（*Heterodera schachtii*）、紅三葉異皮線蟲（*Heterodera trifolii*）、以及其他異皮線蟲屬種類（Heterodera species）；種癭線蟲（Seed gall nematodes）、粒線蟲屬種類（Anguina species）；莖及葉面線蟲（Stem and foliar nematodes）、滑刃線蟲屬種類（Aphelenchoides species）；刺毛線蟲（Sting nematodes）、長尾刺線蟲（*Belonolaimus longicaudatus*）以及其他刺線蟲屬種類；松樹線蟲（Pine nematodes）、松材線蟲（*Bursaphelenchus xylophilus*）以及其他

傘滑刃屬種類（Bursaphelenchus species）；環形線蟲（Ring nematodes）、環線蟲屬種類（Criconema species）、小環線蟲屬種類（Criconemella species）、輪線蟲屬種類（Criconemoides species）、中環線蟲屬種類（Mesocriconema species）；莖及鱗莖線蟲（Stem and bulb nematodes）、腐爛莖線蟲（*Ditylenchus destructor*）、鱗莖莖線蟲（*Ditylenchus dipsaci*）以及其他莖線蟲屬種類（Ditylenchus species）；錐線蟲（*Awl nematodes*）、錐線蟲屬種類（Dolichodorus species）；螺旋線蟲（Spiral nematodes）、多頭螺旋線蟲（*Heliocotylenchus multicinctus*）以及其他螺旋線蟲屬種類（Helicotylenchus species）；鞘及鞘形線蟲（Sheath and sheathoid nematodes）、鞘線蟲屬種類（Hemicycliophora species）以及半輪線蟲屬種類（Hemicriconemoides species）；潛根線蟲屬種類（Hirshmanniella species）；支線蟲（*Lance nematodes*）、冠線蟲屬種類（Hoploaimus species）；假根結線蟲（false rootknot nematodes）、珍珠線蟲屬種類（Nacobbus species）；針狀線蟲（Needle nematodes）、橫帶長針線蟲（*Longidorus elongatus*）以及其他長針線蟲屬種類（Longidorus species）；大頭針線蟲（Pin nematodes）、短體線蟲屬種類（Pratylenchus species）；腐線蟲（*Lesion nematodes*）、花斑短體線蟲（*Pratylenchus neglectus*）、穿刺短體線蟲（*Pratylenchus penetrans*）、彎曲短體線蟲（*Pratylenchus curvitatus*）、古氏短體線蟲（*Pratylenchus goodeyi*）以及其他短體線蟲屬種類（Pratylenchus species）；柑桔穿孔線蟲（Burrowing nematodes）、香蕉穿孔線蟲（*Radopholus similis*）以及其他內侵線蟲屬種類（Radopholus species）；腎形線蟲（*Reniform nematodes*）、羅柏氏盤旋線蟲（*Rotylenchus robustus*）、腎形盤旋線蟲（*Rotylenchus reniformis*）以及其他盤旋線蟲屬種類（Rotylenchus species）；盾線蟲屬種類（*Scutellonema species*）；短粗根線蟲（*Stubby root nematodes*）、原始毛刺線蟲（*Trichodorus primitivus*）以及其他毛刺線蟲屬種類（*Trichodorus species*）、擬毛刺線蟲屬種類（Paratrichodorus species）；矮化線蟲（*Stunt*

nematodes）、馬齒莧矮化線蟲（*Tylenchorhynchus claytoni*）、順逆矮化線蟲（*Tylenchorhynchus dubius*）以及其他矮化線蟲屬種類（Tylenchorhynchus species）；柑桔線蟲（*Citrus nematodes*）、穿刺線蟲屬種類（Tylenchulus species）；短劍線蟲（*Dagger nematodes*）、劍線蟲屬種類（Xiphinema species）；以及其他植物寄生的線蟲種類，如亞粒線蟲屬（*Subanguina spp.*）、*Hypsoperine*屬、大刺環線蟲屬（*Macroposthonia spp.*）、*Melinius*屬、刻點胞囊屬（*Punctodera spp.*）、以及五溝線蟲屬（*Quinisulcius spp.*）。

【0195】 本發明所述的化合物還具有針對軟體動物的活性。該等軟體動物的實例包括例如蘋果螺科；阿勇蛞蝓屬（*Arion*）（灰黑阿勇蛞蝓（*A. ater*）、環斑阿勇蛞蝓（*A. circumscriptus*）、庭院阿勇蛞蝓（*A. hortensis*）、紅棕阿勇蛞蝓（*A. rufus*））；巴蝸牛科（灌木巴蝸牛（*Bradybaena fruticum*））；蝸牛屬（庭院蝸牛（*C. hortensis*）、森林蝸牛（*C. Nemoralis*））；*ochlodina*；灰蛞蝓屬（*Deroceras*）（野灰蛞蝓（*D. agrestis*）、*D. empiricorum*、田灰蛞蝓（*D. laeve*）、庭園灰蛞蝓（*D. reticulatum*））；圓盤螺屬（*Discus*）（*D. rotundatus*）；*Euomphalia*；土蝸屬（*Galba*）（截形土蝸（*G. trunculata*））；小蝸牛屬（*Helicelia*）（伊塔拉小蝸牛（*H. itala*）、布維小蝸牛（*H. obvia*））；大蝸牛科*Helicigona arbustorum*）；*Helicodiscus*；大蝸牛屬（*Helix*）（開放大蝸牛（*H. aperta*））；蛞蝓屬（*Limax*）（灰黑蛞蝓（*L. cinereoniger*）、黃蛞蝓（*L. flavus*）、邊緣蛞蝓（*L. marginatus*）、大蛞蝓（*L. maximus*）、柔蛞蝓（*L. tenellus*））；椎實螺屬（*Lymnaea*）；*Milax*（*M. gagates*、*M. marginatus*、*M. sowerbyi*）；鑽螺屬（*Opeas*）；瓶螺屬（*Pomacea*）（*P. canaticulata*）；瓦婁蝸牛屬（*Vallonia*）和*Zanitoides*。

【0196】 術語"作物"應理解為還包括已經藉由使用重組DNA技術而被這樣轉形使其能夠合成一種或多種選擇性作用毒素的作物植物，該等毒素如已知，例如來自產毒素的細菌，尤其是桿菌屬的細菌。

【0197】 可以藉由此類轉基因植物表現的毒素包括例如來自於枯草芽孢桿菌或日本甲蟲芽孢桿菌的殺昆蟲蛋白；或來自於蘇雲金芽孢桿菌的殺昆蟲蛋白，如δ-內毒素，例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C，或植物性殺昆蟲蛋白（Vip），例如Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A；或線蟲寄生性細菌的殺昆蟲蛋白，例如光桿狀菌屬或致病桿菌屬，如發光光桿狀菌、嗜線蟲致病桿菌；由動物產生的毒素，如蠍毒素、蜘蛛毒素、黃蜂毒素和其他昆蟲特異性神經毒素；由真菌產生的毒素，如鏈黴菌毒素（Streptomycetes toxin）；植物凝集素，如豌豆凝集素、大麥凝集素或雪花蓮凝集素；凝集素類；蛋白酶抑制劑，如胰蛋白酶抑制劑、絲胺酸蛋白酶抑制劑、馬鈴薯貯存蛋白（patatin）、半胱胺酸蛋白酶抑制劑、木瓜蛋白酶抑制劑；核糖體失活蛋白（RIP），如蓖麻蛋白、玉米-RIP、相思豆毒蛋白、絲瓜籽毒蛋白、皂草毒素蛋白或異株瀉根毒蛋白；類固醇代謝酶，如3-羥基類固醇氧化酶、蜕皮類固醇-UDP-醣苷基-轉移酶、膽固醇氧化酶、蜕皮激素抑制劑、HMG-COA-還原酶，離子通道阻斷劑，如鈉通道或鈣通道阻斷劑，保幼激素酯酶，利尿激素受體、苙合成酶、聯苄合成酶、幾丁質酶和葡聚糖酶。

【0198】 在本發明的上下文中，δ-內毒素例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C，或植物性殺昆蟲蛋白（Vip）例如Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A應理解為顯然還包括混合型毒素、截短的毒素和經修飾的毒素。混合型毒素係藉由那些蛋白的不同結構域的新組合重組產生的（參見例如，WO 02/15701）。截短的毒素例如截短的Cry1Ab係已知的。在經修飾毒素的情況下，天然存在的毒素的一個或多個胺基酸被置換。在這樣的胺基酸置換中，較佳的是將非天然存在的蛋白酶識別序列插入毒素中，例如像在Cry3A055的情況下，組織蛋白酶-G-識別序列被插入Cry3A毒素中（參見WO 03/018810）。

【0199】 這樣的毒素或能夠合成這樣的毒素的轉基因植物的實例揭露於

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。

【0200】 用於製備這樣的轉基因植物的方法對於熟習該項技術者是已知的並且描述在例如以上提及的公開物中。CryI型去氧核糖核酸及其製備例如從WO 95/34656、EP-A-0 367 474、EP-A-0 401 979以及WO 90/13651中已知。

【0201】 包括在轉基因植物中的毒素使得植物對有害昆蟲有耐受性。這樣的昆蟲可以存在於任何昆蟲分類群，但尤其常見於甲蟲（鞘翅目）、雙翅昆蟲（雙翅目）和蛾（鱗翅目）。

【0202】 包含一個或多個編碼殺昆蟲劑抗性並且表現一種或多種毒素的基因的轉基因植物係已知的並且其中一些係可商購的。YieldGard®（玉米品種，表現Cry1Ab毒素）；YieldGard Rootworm®（玉米品種，表現Cry3Bb1毒素）；YieldGard Plus®（玉米品種，表現Cry1Ab和Cry3Bb1毒素）；Starlink®（玉米品種，表現Cry9C毒素）；Herculex I®（玉米品種，表現Cry1Fa2毒素和實現對除草劑草丁膦銨的耐受性的酶膦絲菌素N-乙醯轉移酶（PAT））；NuCOTN 33B®（棉花品種，表現Cry1Ac毒素）；Bollgard I®（棉花品種，表現Cry1Ac毒素）；Bollgard II®（棉花品種，表現Cry1Ac和Cry2Ab毒素）；VipCot®（棉花品種，表現Vip3A和Cry1Ab毒素）；NewLeaf®（馬鈴薯品種，表現Cry3A毒素）；NatureGard®，Agrisure® GT Advantage（GA21耐草甘膦性狀），Agrisure® CB Advantage（Bt11玉米螟（CB）性狀）以及Protecta®。

【0203】 這樣的轉基因作物的其他實例係：

1. **Bt11玉米**，來自Syngenta Seeds SAS[先正達種子公司]，Chemin de l'Hobit[霍比特路]27，F-31 790 St. Sauveur, France[聖蘇維爾，法國]，登記號C/FR/96/05/10。遺傳修飾的玉蜀黍，藉由轉基因表現截短的Cry1Ab毒素，使之能抵抗歐洲玉米螟（玉米螟和粉莖螟）的侵襲。Bt11玉米還轉基因地表現PAT酶

以達到對除草劑草丁膦銨的耐受性。

2. **Bt176玉米**，來自Syngenta Seeds SAS[先正達種子公司]，Chemin de l'Hobit[霍比特路]27，F-31 790 St. Sauveur, France[聖蘇維爾，法國], 登記號C/FR/96/05/10。遺傳修飾的玉蜀黍，藉由轉基因表現Cry1Ab毒素，使之能抵抗歐洲玉米螟（玉米螟和粉莖螟）的侵襲。Bt176玉米還轉基因表現PAT酶以實現對除草劑草丁膦銨鹽的耐受性。

3. **MIR604玉米**，來自Syngenta Seeds SAS[先正達種子公司]，Chemin de l'Hobit[霍比特路]27，F-31 790 St. Sauveur, France[聖蘇維爾，法國], 登記號C/FR/96/05/10。藉由轉基因表現經修飾的Cry3A毒素使之具有昆蟲抗性的玉米。此毒素係藉由插入組織蛋白酶-G-蛋白酶識別序列而經修飾的Cry3A055。此類轉基因玉米植物的製備描述於WO 03/018810中。

4. **MON 863玉米**，來自Monsanto Europe S.A.[孟山都歐洲公司], 270-272 Avenue de Tervuren[特弗倫大道]，B-1150 Brussels, Belgium[布魯塞爾，比利時], 登記號C/DE/02/9。MON *863*表現Cry3Bb1毒素，並且對某些鞘翅目昆蟲有抗性。

5. **IPC 531棉花**，來自孟山都歐洲公司，270-272特弗倫大道，B-1150布魯塞爾，比利時，登記號C/ES/96/02。

6. **1507玉米**，來自先鋒海外公司（Pioneer Overseas Corporation），特德斯科大道（Avenue Tedesco），7 B-1160布魯塞爾，比利時，登記號C/NL/00/10。遺傳修飾的玉米，表現蛋白質Cry1F以獲得對某些鱗翅目昆蟲的抗性，並且表現PAT蛋白質以獲得對除草劑草丁膦銨的耐受性。

7. **NK603 × MON 810玉米**，來自Monsanto Europe S.A.[孟山都歐洲公司], 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium[特弗倫大道，B-1150布魯塞爾，比利時], 登記號C/GB/02/M3/03。藉由將遺傳修飾的品種NK603和MON 810雜交，由常規育種的雜交玉米品種構成。NK603 × MON 810玉米轉基因地表

現由土壤桿菌屬菌株CP4獲得的蛋白質CP4 EPSPS，使之耐除草劑Roundup®（含有草甘膦），以及由蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克亞種獲得的Cry1Ab毒素，使之耐某些鱗翅目昆蟲，包括歐洲玉米螟。

【0204】 抗昆蟲的植物的轉基因作物還描述於BATS（生物安全與可持續發展中心（Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit），BATS中心（Zentrum BATS），克拉斯崔舍（Clarastrasse）13，巴塞爾（Basel）4058，瑞士）報告2003（http://bats.ch）中。

【0205】 術語"作物"應理解為還包括已經藉由使用重組DNA技術而被這樣轉化使其能夠合成具有選擇性作用的抗病原物質的作物，該等抗病原物質係例如像所謂的"病程相關蛋白"（PRP，參見例如EP-A-0 392 225）。這樣的抗病原物質和能夠合成這樣的抗病原物質的轉基因植物的實例例如從EP-A-0 392 225、WO 95/33818和EP-A-0 353 191係已知的。生產這樣的轉基因植物之方法對於熟習該項技術者而言通常是已知的並且描述於例如以上提及的公開物中。

【0206】 可以由此類轉基因植物表現的抗病原物質包括，例如，離子通道阻斷劑（例如鈉和鈣通道阻斷劑，像病毒的KP1、KP4或KP6毒素）；芪合成酶；聯苄合成酶；幾丁質酶；葡聚糖酶；所謂的"病程相關蛋白"（PRP，參見例如EP-A-0 392 225）；由微生物產生的抗病原物質，例如涉及植物病原體防禦的肽抗生素或雜環類抗生素（參見例如WO 95/33818）或蛋白質或多肽因子（所謂的"植物疾病抗性基因"，如描述於WO 03/000906中的）。

【0207】 根據本發明的組成物的其他使用範圍係保護所儲存的貨物和儲藏室以及保護原材料，如木材、紡織品、地板或建築物，以及在衛生領域中，尤其是保護人類、家畜以及多產的牲畜免遭所提及類型的有害生物。

【0208】 本發明還提供了用於控制有害生物（如蚊科和其他的疾病媒介物）的方法；也可參見http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/）的方法。

在一個實施方式中，用於控制有害生物的方法包括藉由塗刷、軋製、噴霧、塗布或浸漬，向目標有害生物、它們的場所或表面或基質施用本發明的組成物。藉由舉例，藉由本發明的方法預期了表面（如牆、天花板或地板表面）的IRS（室內滯留噴霧）施用。在另一個實施方式中，考慮到了將此類組成物施用於如下基底，如非紡或織物材料，該材料處於網織品、被覆物、被褥、窗簾以及帳篷的形式（或可以用於在該等物品的製造中使用）。

【0209】 在一個實施方式中，用於控制這樣的有害生物的方法包括向目標有害生物、它們的場所或表面或基質施用殺有害生物有效量的本發明的組成物，以便於在該表面或基質上提供有效的滯留的殺有害生物活性。這樣的施用可以藉由塗刷、滾塗（rolling）、噴霧、塗布或浸漬本發明的殺有害生物組成物來進行。藉由舉例，藉由本發明的方法預期了表面（如牆、天花板或地板表面）的IRS施用，以便於在該表面上提供有效的滯留的殺有害生物活性。在另一個實施方式中，考慮了施用這樣的組成物以用於在基底上的有害生物的殘留控制，該基底係如處於網織品、被覆物、被褥、窗簾以及帳篷的形式（或可以用於在該等物品的製造中）的織物材料。

【0210】 待處理的基質（包括無紡物、織物或網織品）可以由天然纖維，如棉花、拉菲亞樹葉纖維、黃麻、亞麻、劍麻、粗麻布或羊毛，或者合成纖維，如聚醯胺、聚酯、聚丙烯、聚丙烯腈等等製成。聚酯係特別適合的。紡織品處理的方法係已知的，例如WO 2008/151984、WO 2003/034823、US 5631072、WO 2005/64072、WO 2006/128870、EP 1724392、WO 2005113886或WO 2007/090739。

【0211】 根據本發明的組成物的其他使用範圍係針對所有觀賞樹木連同所有種類的果樹和堅果樹的樹木注射/樹幹處理領域。

【0212】 在樹木注射/樹幹處理領域中，根據本發明的該等化合物特別適合於對抗來自上述的鱗翅目和來自鞘翅目的鑽木昆蟲，尤其是對抗下表A和B中

列出的鑽木蟲：

〔表A.〕 具有經濟重要性的外來鑽木蟲的實例.

科	種	受侵染的宿主或作物
吉丁蟲科	*白蠟窄吉丁*	白蠟木（Ash）
天牛科	*光肩天牛*	硬木
小蠹科	*Xylosandrus crassiusculus*	硬木
	削尾材小蠹	硬木
	縱坑切梢小蠹	松柏類植物

〔表B.〕 具有經濟重要性的本地鑽木蟲的實例。

科	種	受侵染的宿主或作物
吉丁蟲科	*樺銅窄吉丁（Agrilus anxius）*	樺樹
	磨光窄吉丁（Agrilus politus）	柳樹、楓樹
	Agrilus sayi	楊梅、香蕨木
	Agrilus vittaticolllis	蘋果樹、梨樹、蔓越橘、唐棣、山楂樹
	蘋扁頭吉丁（Chrysobothris femorata）	蘋果、杏、山毛櫸、白蠟槭、櫻桃樹、栗樹、紅醋栗樹、榆樹、山楂樹、樸樹、山核桃、歐洲七葉樹、菩提樹、楓樹、歐洲花楸樹、橡樹、美洲山核桃樹、梨樹、桃樹、柿子樹、李子樹、楊樹、溫柏、美國紫荊、唐棣、美國梧桐、核桃樹、柳樹
	Texania campestris	椴木、山毛櫸、楓樹、橡樹、美國梧桐、柳樹、黃楊
天牛科	*對山毛櫸天牛（Goes pulverulentus）*	山毛櫸、榆樹、納托爾（Nuttall）、柳樹、黑橡樹、櫻皮鐮狀櫟、黑櫟、美國梧桐
	虎橡天牛（Goes tigrinus）	橡樹
	黑腹尼虎天牛（Neoclytus acuminatus）	白蠟木、山核桃樹、橡樹、核桃樹、樺樹、山毛櫸、楓樹、美洲鐵木（Eastern hophornbeam）、山茱萸、柿子樹、美國紫荊、冬青、

科	種	受侵染的宿主或作物
		樸樹、洋槐、美國皂莢木（Honeylocust）、黃楊、栗樹、奧塞奇橙木（Osage-orange）、黃樟、紫丁香、短葉紫杉（Mountain-mahogany）、梨樹、櫻桃樹、李子樹、桃樹、蘋果樹、榆樹、菩提樹、楓香
	三線無花果天牛（Neoptychodes trilineatus）	無花果樹、赤楊木、桑樹、柳樹、網葉樸樹（Netleaf hackberry）
	灰翅筒天牛（Oberea ocellata）	漆樹、蘋果樹、桃樹、李子樹、梨樹、紅醋栗樹、黑莓
	Oberea tripunctata	山茱萸、莢蒾屬、榆樹、酸模樹、藍莓、杜鵑花屬、杜鵑、月桂樹、楊樹、柳樹、桑樹
	繞枝溝脛天牛（Oncideres cingulata）	山核桃樹、美洲山核桃樹、柿子樹、榆樹、酸模樹、菩提樹、美國皂莢木、山茱萸、桉樹、橡樹、樸樹、楓樹、果樹
	對楊黃斑楔天牛（Saperda calcarata）	楊樹
	Strophiona nitens	栗樹、橡樹、山核桃樹、核桃樹、山毛櫸、楓樹
小蠹科	*Corthylus columbianus*	楓樹、橡樹、黃楊、山毛櫸、白蠟槭、美國梧桐、樺樹、菩提樹、栗樹、榆樹
	南方松大小蠹（Dendroctonus frontalis）	松樹
	美樺毛小蠹（Dryocoetes betulae）	樺樹、楓香、野櫻桃樹、山毛櫸、梨樹
	黃帶芳小蠹（Monarthrum fasciatum）	橡樹、楓樹、樺樹、栗樹、楓香、藍果木、楊樹、山核桃樹、含羞草、蘋果樹、桃樹、松樹
	桃鰓角小蠹（Phloeotribus liminaris）	桃樹、櫻桃樹、李子樹、黑

科	種	受侵染的宿主或作物
		櫻桃樹、榆樹、桑樹、歐洲花楸樹
	Pseudopityophthorus pruinosus	橡樹、美國山毛櫸木、黑櫻桃樹、契卡索李子樹（Chickasaw plum）、栗樹、楓樹、山核桃樹、角樹、鐵木
透翅蛾科	*棟透翅蛾（Paranthrene simulans）*	橡樹、美洲栗樹
	Sannina uroceriformis	柿子樹
	小桃翅蛾	桃樹、李子樹、油桃樹、櫻桃樹、杏樹、扁桃樹、黑櫻桃樹
	李桃翅蛾（Synanthedon pictipes）	桃樹、李子樹、櫻桃樹、山毛櫸、黑櫻桃樹
	Synanthedon rubrofascia	藍果樹
	Synanthedon scitula	山茱萸、美洲山核桃、山核桃樹、橡樹、栗樹、山毛櫸、樺樹、黑櫻桃樹、榆樹、歐洲花楸樹、莢蒾屬、柳樹、蘋果樹、枇杷樹、九層皮、楊梅
	Vitacea polistiformis	葡萄樹

【0213】 本發明也可以用於控制任何可以存在於草坪草中的昆蟲有害生物，包括例如甲蟲、毛蟲、火蟻、地面珍珠（ground pearl）、千足蟲、潮蟲、蠕蟲、螻蛄、介殼蟲、粉蚧蜱、沫蟬、南方麥小蝽以及蟎蟲。本發明可以用於控制處於其生命週期的各個階段的昆蟲有害生物，包括卵、幼蟲、若蟲和成蟲。

【0214】 具體而言，本發明可以用於控制取食草坪草的根部的昆蟲有害生物，該等昆蟲有害生物包括蟎蟲（如圓頭犀金龜屬（*Cyclocephala spp.*）（例如蒙面金龜子，*C. lurida*）、*Rhizotrogus*屬（例如歐洲金龜子，歐洲切根鰓金龜（*R. majalis*））、黃艫屬（*Cotinus spp.*）（例如綠六月甲蟲（Green June beetle），*C. nitida*）、弧麗金龜屬（*Popillia spp.*）（例如日本甲蟲，龜紋瓢蟲（*P. japonica*））、鰓角金龜屬（*Phyllophaga spp.*）（例如五月/六月甲蟲）、*Ataenius*屬（例如草坪

草黑金龜（Black turfgrass ataenius），*A. spretulus*）、絨毛金龜屬（*Maladera spp.*）（例如亞洲花園甲蟲（Asiatic garden beetle），*M. castanea*）以及*Tomarus*屬），地面珍珠（碩蚡屬（*Margarodes* spp.）），螻蛄（褐黃色的、南方的、以及短翅的；痣蟋蟀屬（*Scapteriscus* spp.），非洲螻蛄（*Gryllotalpa africana*））以及大蚊幼蟲（leatherjackets）（歐洲大蚊（European crane fly），大蚊屬（*Tipula spp.*））。

【0215】 本發明還可以用於控制茅草住宅的草坪草的昆蟲有害生物，該等昆蟲有害生物包括黏蟲（如秋夜蛾（fall armyworm）草地貪夜蛾（*Spodoptera frugiperda*），和常見夜蛾一星黏蟲（*Pseudaletia unipuncta*））、切根蟲，象鼻蟲（尖隱喙象屬（*Sphenophorus spp.*），如*S. venatus verstitus*和牧草長喙象（*S. parvulus*））以及草地螟（如草螟屬（*Crambus spp.*）和熱帶草地螟，*Herpetogramma phaeopteralis*）。

【0216】 本發明還可以用於控制在地上生活並取食草坪草葉子的草坪草中的昆蟲有害生物，該等昆蟲有害生物包括麥小蜡（如南方麥小蜡，南方桿長蜡（*Blissus insularis*））、狗牙根蠕（Bermudagrass mite）（*Eriophyes cynodoniensis*）、蓋氏虎尾草粉蚧（草竹粉蚧（*Antonina graminis*））、兩線沫蟬（*Propsapia bicincta*）、葉蟬、切根蟲（夜蛾科）、以及麥二叉蚜。

【0217】 本發明還可以用於控制草坪草中的其他有害生物，如在草坪中創建蟻巢的外引紅火蟻（紅火蟻（*Solenopsis invicta*））。

【0218】 在衛生領域中，根據本發明的組成物係有效地對抗外寄生蟲如硬蜱、軟蜱、疥蟎、秋蟎、蠅（叮咬和舔舐）、寄生性蠅幼蟲，虱、發虱、鳥虱和跳蚤。

【0219】 這樣的寄生蟲的實例係：

【0220】 虱目：血虱屬（Haematopinus spp）、長顎虱屬（Linognathus spp.）、人虱屬（Pediculus spp.）和陰虱屬（Phtirus spp.）、盲虱屬（Solenopotes spp.）。

【0221】 食毛目：毛羽虱屬（Trimenopon spp.）、短角鳥虱屬（Menopon spp.）、鴨虱屬（Trinoton spp.）、牛羽虱屬（Bovicola spp.）、Werneckiella屬、Lepikentron屬、畜虱屬（Damalina spp.）、齧毛虱屬（Trichodectes spp.）以及貓羽虱屬（Felicola spp.）。

【0222】 雙翅目及長角亞目和短角亞目，例如伊蚊屬（Aedes spp.）、按蚊屬（Anopheles spp.）、庫蚊屬（Culex spp.）、蚋屬（Simulium spp.）、真蚋屬（Eusimulium spp.）、白蛉屬（Phlebotomus spp.）、羅蛉屬（Lutzomyia spp.）、庫蠓屬（Culicoides spp.）、斑虻屬（Chrysops spp.）、駝背虻屬（Hybomitra spp.）、黃虻屬（Atylotus spp.）、虻屬（Tabanus spp.）、麻虻屬（Haematopota spp.）、Philipomyia屬（Philipomyia spp.）、蜂虱蠅屬（Braula spp.）、家蠅屬（Musca spp.）、齒股蠅屬（Hydrotaea spp.）、螯蠅屬（Stomoxys spp.）、黑角蠅屬（Haematobia spp.）、莫蠅屬（Morellia spp.）、廁蠅屬（Fannia spp.）、舌蠅屬（Glossina spp.）、麗蠅屬（Calliphora spp.）、綠蠅屬（Lucilia spp.）、金蠅屬（Chrysomyia spp.）、污蠅屬（Wohlfahrtia spp.）、麻蠅屬（Sarcophaga spp.）、狂蠅屬（Oestrus spp.）、皮蠅屬（Hypoderma spp.）、胃蠅屬（Gasterophilus spp.）、虱蠅屬（Hippobosca spp.）、羊虱蠅屬（Lipoptena spp.）和蜱蠅屬（Melophagus spp.）。

【0223】 蚤目，例如蚤屬、櫛頭蚤屬、客蚤屬、角葉蚤屬。

【0224】 異翅目，例如臭蟲屬、錐鼻蟲屬屬、紅獵蝽屬、錐蝽屬。

【0225】 蜚蠊目，例如 東方蜚蠊、美洲大蠊、德國小蠊以及夏柏拉蟑螂屬。

【0226】 蜱蟎亞綱（蟎科）和後氣門目和中氣門目（Meta- and Meso-stigmata），例如銳緣蜱屬（Argas spp.）、鈍緣蜱屬（Ornithodorus spp.）、耳蜱屬（Otobius spp.）、硬蜱屬（Ixodes spp.）、鈍眼蜱屬（Amblyomma spp.）、牛蜱屬（Boophilus spp.）、革蜱屬（Dermacentor spp.）、血蜱屬（Haemophysalis

spp.）、璃眼蜱屬（Hyalomma spp.）、扇頭蜱屬（Rhipicephalus spp.）、皮刺螨屬（Dermanyssus spp.）、刺利螨屬（Raillietia spp.）、肺刺螨屬（Pneumonyssus spp.）、胸刺螨屬（Sternostoma spp.）和瓦螨屬（Varroa spp.）。

【0227】 軸螨目（前氣門亞目）和粉螨目（無氣門亞目），例如蜂盾螨屬（Acarapis spp.）、姬螯屬（Cheyletiella spp.）、禽螯螨屬（Ornithocheyletia spp.）、肉螨屬（Myobia spp.）、瘡螨屬（Psorergatesspp.）、蠕形螨屬（Demodex spp.）、恙螨屬（Trombicula spp.）、犛螨屬（Listrophorus spp.）、粉螨屬（Acarus spp.）、食酪螨屬（Tyrophagus spp.）、嗜木螨屬（Caloglyphus spp.）、頸下螨屬（Hypodectes spp.）、翅螨屬（Pterolichus spp.）、癢螨屬（Psoroptes spp.）、皮螨屬（Chorioptes spp.）、耳疥螨屬（Otodectes spp.）、疥螨屬（Sarcoptes spp.）、耳螨屬（Notoedres spp.）、鳥疥螨屬（Knemidocoptes spp.）、胞螨屬（Cytodites spp.）以及雞雛螨屬（Laminosioptes spp.）。

【0228】 根據本發明的組成物還適用於保護材料如木材、紡織品、塑膠、黏合劑、膠、漆料、紙張和卡片、皮革、地板和建築等免受昆蟲侵染。

【0229】 根據本發明的組成物可以用於例如對抗以下有害生物：甲蟲，如北美家天牛（Hylotrupes bajulus）、長毛天牛（Chlorophorus pilosis）、傢俱竊蠹（Anobium punctatum）、紅毛竊蠹（Xestobium rufovillosum）、梳角細脈竊蠹（Ptilinuspecticornis）、石斛（Dendrobium pertinex）、松芽枝竊蠹（Ernobius mollis）、松產品竊蠹（Priobium carpini）、褐粉蠹（Lyctus brunneus）、非洲粉蠹（Lyctus africanus）、南方粉蠹（Lyctus planicollis）、櫟粉蠹（Lyctus linearis）、柔毛粉蠹（Lyctus pubescens）、胸粉蠹（Trogoxylon aequale）、鱗毛粉蠹（Minthesrugicollis）、材小蠹屬（Xyleborus spec）、條木小蠹屬（Tryptodendron spec.）、咖啡黑長蠹（Apate monachus）、樹長蠹（Bostrychus capucins）、棕異翅長蠹（Heterobostrychus brunneus）、雙棘長蠹屬（Sinoxylon spec）與竹長

蠹（Dinoderus minutus）；以及膜翅類昆蟲，如藍黑樹蜂（Sirex juvencus）、雲杉大樹蜂（Urocerus gigas）、泰加大樹蜂（Urocerus gigas taignus）與大樹蜂（Urocerus augur）；以及白蟻，如歐洲木白蟻（Kalotermes flavicollis）、麻頭堆砂白蟻（Cryptotermes brevis）、印巴結構木異白蟻（Heterotermes indicola）、黃胸散白蟻（Reticulitermes flavipes）、桑特散白蟻（Reticulitermes santonensis）、散白蟻（Reticulitermes lucifugus）、達爾文澳白蟻（Mastotermes darwiniensis）、、內華達古白蟻（Zootermopsis nevadensis）與家白蟻（Coptotermes formosanus）；以及蛀蟲，如衣魚（Lepisma saccharina）。

【0230】 根據本發明的化合物可以按未經修飾的形式用作殺有害生物劑，但它們通常以多種方式使用配製佐劑（如載體、溶劑以及表面活性物質）被配製成組成物。該等配製物可以處於不同的實體形式，例如，處於以下形式：撒粉劑、凝膠、可濕性粉劑、水可分散性顆粒劑、水可分散性片劑、泡騰壓縮片劑、可乳化的濃縮物、微可乳化濃縮物、水包油乳劑、可流動油、水性分散體、油性分散體、懸乳劑、膠囊懸浮液、可乳化的顆粒劑、可溶性液體、水可溶性濃縮物（以水或水混溶性有機溶劑作為載體）、浸漬的聚合物膜或處於已知的其他形式，例如從關於殺有害生物劑的FAO和WHO標準的發展和使用的手冊（Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides），聯合國，第1版，二次修訂（2010）中已知的。此類配製物可以直接使用或者可以使用前稀釋再使用。可以利用例如水、液體肥料、微量營養素、生物有機體、油或溶劑來稀釋。

【0231】 可以藉由例如將活性成分與配製物佐劑混合來製備該等配製物以便獲得處於精細分散固體、顆粒、溶液、分散體或乳劑形式的組成物。該等活性成分還可以與其他佐劑（例如精細分散固體、礦物油、植物或動物的油、修飾的植物或動物的油、有機溶劑、水、表面活性物質或它們的組合）來一起

配製。

【0232】 該等活性成分還可以被包含於非常精細的微膠囊中。微膠囊在多孔載體中含有該等活性成分。這使該等活性成分能以受控的量（例如，緩慢釋放）釋放到環境中。微膠囊通常具有從0.1到500微米的直徑。它們包含的活性成分的量按重量計係膠囊重量的約從25%至95%。該等活性成分可以處於整體性的固體的形式、處於固體或液體分散體中的精細顆粒的形式或處於合適溶液的形式。包囊的膜可以包括例如天然的或合成的橡膠、纖維素、苯乙烯/丁二烯共聚物、聚丙烯腈、聚丙烯酸酯、聚酯、聚醯胺、聚脲、聚胺酯或化學修飾的聚合物以及澱粉黃原酸鹽、或熟習該項技術者已知的其他聚合物。可替代地，可以形成非常精細的微膠囊，其中活性成分在基礎物質的固體基質中是以精細分散顆粒的形式被包含的，但該等微膠囊本身未經包裹。

【0233】 適合於製備根據本發明所述的該等組成物的配製佐劑本身是已知的。作為液體載體可以使用：水、甲苯、二甲苯、石油醚、植物油、丙酮、甲基乙基酮、環己酮、酸酐、乙腈、乙醯苯、乙酸戊酯、2-丁酮、碳酸丁烯酯、氯苯、環己烷、環己醇、乙酸烷基酯的乙酸、二丙酮醇、1,2-二氯丙烷、二乙醇胺、對-二乙基苯、二甘醇、松脂酸二甘醇酯、二甘醇丁基醚、二甘醇乙基醚、二甘醇甲醚、*N*,*N*-二甲基甲醯胺、二甲基亞碸、1,4-二噁烷、雙丙甘醇、雙丙甘醇甲基醚、雙丙甘醇二苯甲酸酯、雙丙甘醇、烷基吡咯啶酮、乙酸乙酯、2-乙基己醇、碳酸乙烯酯、1,1,1-三氯乙烷、2-庚酮、α-蒎烯、d-檸烯、乳酸乙酯、乙二醇、乙二醇丁基醚、乙二醇甲基醚、γ-丁內酯、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、乙酸異戊基酯、乙酸異冰片基（bornyl）酯、異辛烷、異佛耳酮、異丙苯、肉豆蔻酸異丙酯、乳酸、月桂胺、異伸丙基丙酮、甲氧基丙醇、甲基異戊基酮、甲基異丁基酮、月桂酸甲酯、辛酸甲酯、油酸甲酯、二氯甲烷、間二甲苯、正己烷、正辛胺、十八烷酸、辛胺乙酸酯、

油酸、油基胺、鄰二甲苯、苯酚、聚乙二醇、丙酸、乳酸丙酯、碳酸丙烯酯、丙二醇、丙二醇甲基醚、對-二甲苯、甲苯、磷酸三乙酯、三乙二醇、二甲苯磺酸、石蠟、礦物油、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、二甘醇甲基醚、甲醇、乙醇、異丙醇以及更高分子量的醇，例如戊醇、四氫呋喃醇、己醇、辛醇、乙二醇、丙二醇、甘油、*N*-甲基-2-吡咯啶酮等。

【0234】 適合的固體載體係，例如滑石、二氧化鈦、葉蠟石黏土、矽石、凹凸棒石黏土、矽藻土、石灰石、碳酸鈣、膨潤土、鈣蒙脫土、棉籽殼、小麥粉、大豆粉、浮石、木粉、胡桃殼粉、木素和類似的物質。

【0235】 許多表面活性物質可以有利地用於固體和液體配製物兩者中，尤其是在使用前可被載體稀釋的那些配製物中。表面活性物質可以是陰離子的、陽離子的、非離子的或聚合的並且它們可以用作乳化劑、濕潤劑或懸浮劑或用於其他目的。典型的表面活性物質包括例如烷基硫酸酯的鹽，如十二烷基硫酸二乙醇銨；烷基芳基磺酸酯的鹽，如十二烷基苯磺酸鈣；烷基酚/氧化烯加成產物，如乙氧基化壬基苯酚；醇/氧化烯加成產物，如乙氧基化十三烷醇；皂，如硬脂酸鈉；烷基萘磺酸酯的鹽，如二丁基萘磺酸鈉；磺基丁二酸二烷基酯的鹽，如二(2-乙基己基)磺基丁二酸鈉；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銨；脂肪酸的聚乙二醇酯，如聚乙二醇硬脂酸酯；環氧乙烷和環氧丙烷的嵌段共聚物；以及磷酸單-和二-烷酯的鹽；以及還有其他物質，例如描述於：McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual[麥卡琴清潔劑和乳化劑年鑒], MC Publishing Corp.[MC出版公司], Ridgewood New Jersey[裡奇伍德新澤西州]（1981）。

【0236】 可以用於殺有害生物配製物的其他佐劑包括結晶作用抑制劑、黏度改性劑、助懸劑、染料、抗氧化劑、發泡劑、光吸收劑、混合助劑、消泡劑、

錯合劑、中和或改變pH的物質與緩衝液、腐蝕抑制劑、香料、濕潤劑、吸收增強劑、微量營養素、塑化劑、助流劑、潤滑劑、分散劑、增稠劑、抗凍劑、殺微生物劑、以及液體與固體肥料。

【0237】 根據本發明的組成物可以包括添加劑，該添加劑包括植物或動物來源的油、礦物油、此類油的烷基酯或此類油與油衍生物的混合物。在根據本發明的組成物中的油添加劑的量通常是該待施用的混合物的0.01%到10%。例如，可以在噴霧混合物已經製備以後將該油添加劑以所希望的濃度加入噴霧罐中。較佳的油添加劑包括礦物油或植物來源的油，例如菜籽油、橄欖油或葵花籽油；乳化的植物油；植物來源的油的烷基酯，例如甲基衍生物；或動物來源的油，如魚油或牛脂。較佳的油添加劑包括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、棕櫚酸以及油酸的甲基酯（分別為月桂酸甲酯、棕櫚酸甲酯和油酸甲酯）。許多油衍生物獲知於以下文獻：Compendium of Herbicide Adjuvants, 10th Edition, Southern Illinois University, 2010[除草劑佐劑綱要，第10版，南伊利諾大學，2010]。

【0238】 該等本發明組成物總體上包括按重量計從0.1%至99%，尤其是按重量計從0.1%至95%的本發明的化合物以及按重量計從1%至99.9%的配製佐劑，該配製佐劑較佳的是包括按重量計從0至25%的表面活性物質。而商用產品可以較佳的是被配製為濃縮物，最終使用者將通常使用稀釋配製物。

【0239】 施用比率在寬範圍之內變化並且取決於土壤的性質、施用方法、作物植物、待控制的有害生物、主要氣候條件、以及受施用方法支配的其他因素、施用時間以及目標作物。一般來講，可以將化合物以從1 l/ha至2000 l/ha，尤其是從10 l/ha到1000 l/ha的比率施用。

【0240】 較佳的配製物可以具有以下組成（重量%）：

乳油：

活性成分：　　1%至95%，較佳的是60%至90%

表面活性劑：　　1%至30%，較佳的是5%至20%

液體載體：　　1%至80%，較佳的是1%至35%

塵劑：

活性成分：　　0.1%至10%，較佳的是0.1%至5%

固體載體：　　99.9%至90%，較佳的是99.9%至99%

懸浮液濃縮物：

活性成分：　　5%至75%，較佳的是10%至50%

水：　　94%至24%，較佳的是88%至30%

表面活性劑：　　1%至40%，較佳的是2%至30%

可濕性粉劑：

活性成分：　　0.5%至90%，較佳的是1%至80%

表面活性劑：　　0.5%至20%，較佳的是1%至15%

固體載體：　　5%至95%，較佳的是15%至90%

顆粒劑：

活性成分：　　0.1%至30%，較佳的是0.1%至15%

固體載體：　　99.5%至70%，較佳的是97%至85%

以下實例進一步闡述了（但不限制）本發明。

可濕性粉劑	a)	b)	c)
活性成分	25%	50%	75%
木質素磺酸鈉	5%	5%	-
十二烷基硫酸鈉	3%	-	5%
二異丁基萘磺酸鈉	-	6%	10%
苯酚聚乙二醇醚（7-8 mol 的環氧乙烷）	-	2%	-
高度分散的矽酸	5%	10%	10%
高嶺土	62%	27%	-

將該組合與該等佐劑充分混合並且將混合物在合適的研磨機中充分研磨，從而給出可以用水稀釋而給出所希望的濃度的懸浮液的可濕性粉劑。

乾種子處理用粉劑	a)	b)	c)
活性成分	25%	50%	75%
輕質礦物油	5%	5%	5%
高度分散的矽酸	5%	5%	-
高嶺土	65%	40%	-
滑石	-		20%

將該組合與該等佐劑充分混合並且將混合物在合適的研磨機中充分研磨，從而給出可以直接用於種子處理的粉劑。

乳油	
活性成分	10%
辛基苯酚聚乙二醇醚（4-5 mol 的環氧乙烷）	3%
十二烷基苯磺酸鈣	3%
蓖麻油聚乙二醇醚（35 mol 的環氧乙烷）	4%
環己酮	30%
二甲苯混合物	50%

在植物保護中可以使用的具有任何所希望的稀釋度的乳液可以藉由用水稀釋從這種濃縮物獲得。

塵劑	a)	b)	c)
活性成分	5%	6%	4%
滑石	95%	-	-
高嶺土	-	94%	-
礦物填料	-	-	96%

藉由將該組合與載體混合並且將混合物在合適的研磨機中研磨獲得立即可用的塵劑。此類粉劑還可以用於種子的乾拌種。

擠出機顆粒劑	
活性成分	15%
木質素磺酸鈉	2%
羧甲基纖維素	1%
高嶺土	82%

將該組合與該等佐劑混合並且研磨，並且將混合物用水濕潤。將混合物擠出並且然後在空氣流中乾燥。

包衣顆粒劑	
活性成分	8%
聚乙二醇（分子量 200）	3%
高嶺土	89%

將精細研磨的組合在混合器中均勻地施用於用聚乙二醇濕潤的高嶺土中。以此方式獲得無塵的包衣顆粒劑。

懸浮液濃縮物

活性成分	40%
丙二醇	10%
壬基酚聚乙二醇醚（15 mol 的環氧乙烷）	6%
木質素磺酸鈉	10%
羧甲基纖維素	1%
矽油（處於在水中 75%的乳液的形式）	1%
水	32%

【0241】 將精細研磨的組合與佐劑密切混合，從而給出懸浮液濃縮物，可以藉由使用水稀釋從該濃縮物獲得任何所希望稀釋度的懸浮液。使用此類稀釋物，可以對活的植物連同植物繁殖材料進行處理並且對其針對微生物侵染藉由噴霧、傾倒或浸漬進行保護。

種子處理用的可流動性濃縮物

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 莫耳 EO	2%
1,2-苯并異噻唑啉-3-酮（處於在水中 20%的溶液形式）	0.5%
單偶氮顏料鈣鹽	5%
矽油（處於在水中 75%的乳液的形式）	0.2%
水	45.3%

【0242】 將精細研磨的組合與佐劑密切混合，從而給出懸浮液濃縮物，可以藉由使用水稀釋從該濃縮物獲得任何所希望稀釋度的懸浮液。使用此類稀釋物，可以對活的植物連同植物繁殖材料進行處理並且對其針對微生物侵染藉由噴霧、傾倒或浸漬進行保護。

緩釋的膠囊懸浮液

【0243】 將28份的組合與2份的芳香族溶劑以及7份的甲苯二異氰酸酯/多亞甲基-聚苯基異氰酸酯-混合物（8：1）進行混合。將此混合物在1.2份的聚乙烯醇、0.05份的消泡劑以及51.6份的水的混合物中進行乳化直至達到所希望的粒度。向此乳液中添加在5.3份的水中的2.8份的1,6-己二胺混合物。將混合物攪拌直至聚合反應完成。將獲得的膠囊懸浮液藉由加入0.25份的增稠劑以及3份的分散劑進行穩定。該膠囊懸浮液配製物含有28%的活性成分。介質膠囊的直徑係8-15微米。將所得配製物作為適用於此目的的裝置中的水性懸浮液施用於種子。

【0244】 配製物類型包括乳液濃縮物（EC）、懸浮液濃縮物（SC）、懸乳液（SE）、膠囊懸浮液（CS）、水可分散性顆粒劑（WG）、可乳化性顆粒劑（EG）、油包水型乳液（EO）、水包油型乳液（EW）、微乳液（ME）、油分散體（OD）、油懸劑（OF）、油溶性液劑（OL）、可溶性濃縮物（SL）、

超低容量懸浮液（SU）、超低容量液劑（UL）、母藥（technical concentrate）（TK）、可分散性濃縮物（DC）、可濕性粉劑（WP）、可溶性顆粒劑（SG）或與農業上可接受的佐劑組合的任何技術上可行的配製物。

製備實施例：

【0245】 “Mp”係指以°C計的熔點。自由基表示甲基基團。^{1}H NMR測量值在Brucker 400MHz分光計上記錄，化學位移相對於TMS標準品以ppm給出。光譜在如指定的氘代溶劑中測量。用以下LCMS方法中的任一種來表徵該等化合物。對於每種化合物獲得的特徵LCMS值係保留時間（“Rt”以分鐘為單位記錄）和測量的分子離子$(M+H)^+$或$(M-H)^-$。

LCMS和GCMS方法：

方法1：

【0246】 在來自沃特斯（Waters）的質譜儀（ZQ單四極質譜儀）上記錄光譜，該質譜儀配備有電灑源（極性：正離子或負離子，毛細管：3.00 kV，錐孔範圍：30 V-60 V，萃取器：2.00 V，源溫度：150°C，去溶劑化溫度：350°C，錐孔氣體流量：0 L/Hr，去溶劑化氣體流量：650 L/Hr；質量範圍：100 Da至900 Da）以及來自沃特斯的Acquity UPLC：二元泵、加熱管柱室以及二極體陣列檢測器）。溶劑脫氣裝置，二元泵，加熱管柱室以及二極體陣列檢測器。管柱：沃特斯UPLC HSS T3，1.8 μm，30 x 2.1 mm，溫度：60°C，DAD波長範圍（nm）：210至500，溶劑梯度：A = 水 + 5% MeOH + 0.05% HCOOH，B = 乙腈 + 0.05% HCOOH：梯度：0 min 0% B，100% A；1.2-1.5 min 100% B；流量（ml/min）0.85。

方法2：

【0247】 在來自沃特斯的質譜儀（SQD或ZQ單四極質譜儀）上記錄光譜，該質譜儀配備有電灑源（極性：正離子或負離子，毛細管：3.00 kV，錐孔範圍：30 V-60 V，萃取器：2.00 V，源溫度：150℃，去溶劑化溫度：350℃，錐孔氣體流量：0 L/Hr，去溶劑化氣體流量：650 L/Hr；質量範圍：100 Da至900 Da）以及來自沃特斯的Acquity UPLC：二元泵、加熱管柱室以及二極體陣列檢測器）。溶劑脫氣裝置，二元泵，加熱管柱室以及二極體陣列檢測器。管柱：沃特斯UPLC HSS T3，1.8 μm，30 x 2.1 mm，溫度：60℃，DAD波長範圍（nm）：210至500，溶劑梯度：A= 水 + 5% MeOH + 0.05% HCOOH，B= 乙腈 + 0.05% HCOOH；梯度：0 min 0% B，100% A；2.7-3.0 min 100% B；流量（ml/min）0.85。

方法3：

【0248】 在來自安捷倫科技（Agilent Technologies）的質譜儀（6410三重四極桿質譜儀）上記錄光譜，該質譜儀配備有電灑源（極性：正和負極轉換：毛細管：4.00 kV，碎裂電壓：100.00 V，氣體溫度：350℃，氣體流量：11 L/min，噴霧器氣體：45 psi，質量範圍：110-1000 Da，DAD波長範圍：210-400 nm）。管柱：KINETEX EVO C18，長度50 mm，直徑4.6 mm，粒度2.6 μm。管柱烘箱溫度40℃。溶劑梯度：A= 含0.1%甲酸的水 : 乙腈（95 : 5 v/v）。B= 含0.1%甲酸的乙腈。梯度 =0 min 90% A，10% B；0.9-1.8 min 0% A，100% B，2.2-2.5 min 90% A，10% B。流速：1.8 mL/min。

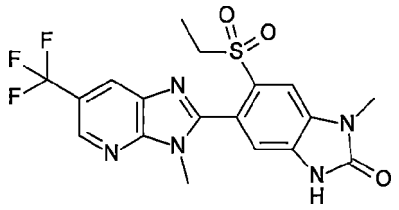
方法4：

【0249】 在來自沃特斯的質譜儀（Acquity SDS質譜儀）上記錄光譜，該質譜儀配備有電灑源（極性：正和負極轉換：毛細管：3.00 kV，錐孔電壓：41.00 V，源溫度：150℃，去溶劑化氣體流量：1000 L/Hr，去溶劑化溫度：500℃，錐

孔氣體流量：50 L/hr，質量範圍：110-800 Da，PDA波長範圍：210-400 nm）。管柱：Acquity UPLC HSS T3 C18，長度30 mm，直徑2.1 mm，粒度1.8 μm。管柱烘箱溫度40℃。溶劑梯度：A＝ 含0.1%甲酸的水 ： 乙腈（95 : 5 v/v）。B＝ 含0.05%甲酸的乙腈。梯度 ＝0 min 90% A，10% B；0.2 min 50% A，50% B；0.7-1.3 min 0% A，100% B；1.4-1.6 min 90% A，10% B。流速：0.8 mL/min。

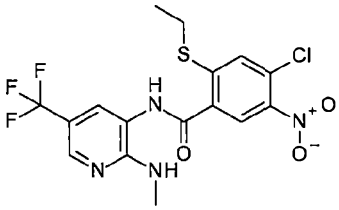
a) 中間體的典型合成：

實施例P1：5-乙基磺醯基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮（化合物I10）的製備：



(I10)

步驟1：4-氯-2-乙基氫硫基-N-[2-(甲基胺基)-5-(三氟甲基)-3-吡啶基]-5-硝基-苯甲醯胺（化合物I1）的製備



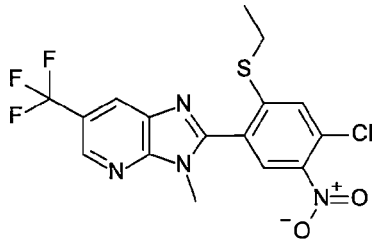
(I1)

【0250】 向還含有N,N-二甲基甲醯胺（0.05 mL，0.60 mmol，0.30當量）的二氯甲烷（15 mL）中的4-氯-2-乙基氫硫基-5-硝基-苯甲酸（500 mg，1.91 mmol，1.00當量，根據WO 2016091731製備）的0℃冷卻溶液中逐滴添加草醯氯（323 μL，3.82 mmol，2.00當量）。在0℃下攪拌2小時後，將反應混合物在減壓下濃縮並且將粗材料直接使用。

【0251】 將四氫呋喃（20 mL）中的4-氯-2-乙基氫硫基-5-硝基-苯甲醯氯（500 mg，1.78 mmol，1.00當量，上文獲得的）的懸浮液緩慢加入四氫呋喃（30

mL）中的N2-甲基-5-(三氟甲基)吡啶-2,3-二胺（682 mg，3.57 mmol，2.00當量，如WO 2016142327中所述製備）和三乙胺（746 μL，5.35 mmol，3.00當量）的預攪拌溶液中。在添加完成後，將反應混合物在室溫下攪拌2小時。然後將混合物傾倒在水上，並且將水相用乙酸乙酯萃取。將合併的有機相經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料在甲醇中研磨以提供所需產物。將此材料不經進一步純化而用於下一步驟。LCMS（方法4）：435/437 $(M+H)^+$；保留時間：0.94 min。

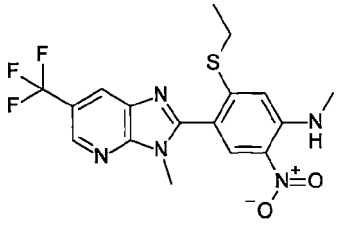
步驟2：2-(4-氯-2-乙基氫硫基-5-硝基-苯基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶（化合物I2）的製備



(I2)

【0252】 將乙酸（20 mL）中的4-氯-2-乙基氫硫基-N-[2-(甲基胺基)-5-(三氟甲基)-3-吡啶基]-5-硝基-苯甲醯胺（450 mg，1.04 mmol，上文製備的化合物I1）的溶液在110℃下加熱並攪拌2小時。冷卻至室溫後，將反應混合物直接蒸發。將粗材料不經純化而用於下一步驟。LCMS（方法4）：417/419 $(M+H)^+$；保留時間：1.03 min。

步驟3：5-乙基氫硫基-N-甲基-4-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-2-硝基-苯胺（化合物I3）的製備

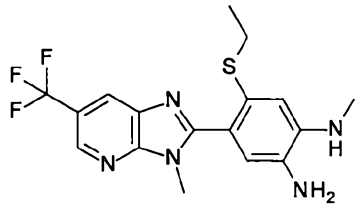


(I3)

【0253】 將甲胺溶液（2.0 mol/L，在四氫呋喃中，5.0 mL，10.0 mmol）

中的2-(4-氯-2-乙基氫硫基-5-硝基-苯基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶（500 mg，1.20 mmol，上文製備的化合物I2）的溶液在60ºC下加熱2小時。冷卻至室溫後，將反應混合物在減壓下濃縮。將材料再次溶於乙酸乙酯中，將有機相用水洗滌，將水相用乙酸乙酯萃取。將合併的有機相經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料在甲醇中研磨以提供所需產物。LCMS（方法4）：412 $(M+H)^+$；保留時間：0.96 min。

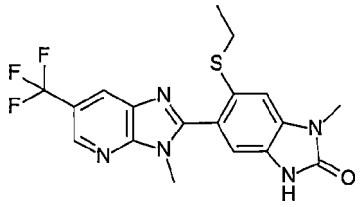
步驟4：4-乙基氫硫基-N2-甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯-1,2-二胺（化合物I4）的製備



(I4)

【0254】 將設置在高壓釜中的乙醇（40 mL）中的5-乙基氫硫基-N-甲基-4-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-2-硝基-苯胺（4.00 g，9.72 mmol，上文製備的化合物I3）的溶液抽空並用氮氣回填，之後添加Pd/C 10%（400 mg，0.37 mmol，0.04當量）。將混合物再次抽空並用氮氣回填，然後用氫氣回填，並在室溫下在5巴氫壓下攪拌2小時。抽空並用氮氣吹掃後，將所得混合物通過矽藻土過濾，並且將獲得的濾液在減壓下濃縮。將粗材料在乙醚中重複研磨兩次，提供所需產物，將其不經進一步純化而直接用於下一步驟。LCMS（方法4）：382 $(M+H)^+$；保留時間：0.85 min。

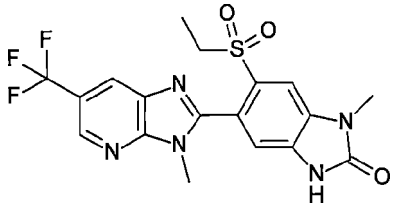
步驟5：5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮（化合物I5）的製備



(I5)

【0255】 將甲苯中的光氣的20% wt溶液（6.25 g，12.7 mmol，1.20當量）逐滴加入二氯甲烷（30 mL）中的粗4-乙基氫硫基-N2-甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯-1,2-二胺（4.00 g，10.5 mmol，1.00當量，上文製備的化合物I4）和三乙胺（2.92 mL，21.0 mmol，2.00當量）的0°C冷卻溶液中。在0°C下攪拌40 min後，將反應混合物用二氯甲烷稀釋並用水緩慢淬滅。將水相用二氯甲烷萃取，將合併的有機相經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。產物從二氯甲烷和環己烷的混合物中沈澱出來，並且不經進一步純化而按原樣使用。LCMS（方法4）：408 $(M+H)^+$；保留時間：0.81 min。

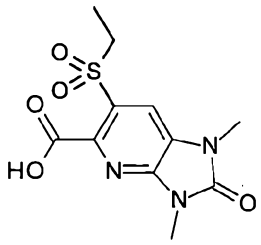
步驟6：5-乙基磺醯基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮（化合物I10）的製備：



(I10)

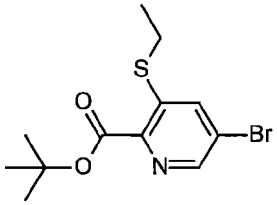
【0256】 將70%質量的3-氯過苯甲酸（180 mg，0.73 mmol，2.00當量）分批加入二氯甲烷（30 mL）中的5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮（150 mg，0.37 mmol，1.00當量，上文製備的化合物I5）的0°C冷卻溶液中。在室溫下攪拌1小時後，將反應混合物用5%氫氧化鈉溶液緩慢淬滅，將有機相用水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）純化，提供所需化合物。LCMS（方法4）：440 $(M+H)^+$；保留時間：0.71 min。

實施例P2：6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-2-側氧基-咪唑并[4,5-b]吡啶-5-甲酸（化合物I38）的製備：



(I38)

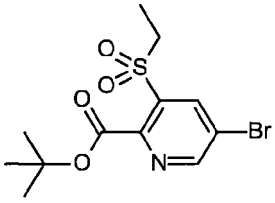
步驟1：5-溴-3-乙基氫硫基-吡啶-2-甲酸三級丁酯（化合物I32）的製備



(I32)

【0257】 在室溫下，將四氫呋喃（13 mL）中的5-溴-3-乙基氫硫基-吡啶-2-碳醯氯（WO 2016/030229）（5.00 g，17.8 mmol）的溶液緩慢加入溶於四氫呋喃（40 mL）中的三級丁醇（17.0 mL，13.2 g，178 mmol）、N,N-二異丙基乙胺（7.70 mL，5.82 g，44.6 mmol）和4-二甲基胺基吡啶（2.29 g，17.8 mmol）中。將反應混合物加熱至60℃並攪拌21小時。添加飽和的NH_4Cl水溶液，並且將水相用乙酸乙酯萃取三次。將有機相合併，用水和鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並蒸發。將殘餘物藉由Combiflash純化，以提供5-溴-3-乙基氫硫基-吡啶-2-甲酸三級丁酯（化合物I32）。^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 1.40 (t, 3H), 1.65 (s, 9H), 2.93 (q, 2H), 7.75 (d, 1H), 8.45 (d, 1H)。

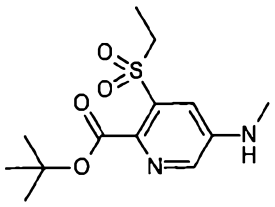
步驟2：5-溴-3-乙基磺醯基-吡啶-2-甲酸三級丁酯（化合物I33）的製備



(I33)

【0258】 在0ºC下，向二氯甲烷（27 mL）中的5-溴-3-乙基氫硫基-吡啶-2-甲酸三級丁酯（1.5 g，4.7 mmol）的溶液中分批添加3-氯過苯甲酸75%（2.2 g，9.7 mmol）。將反應混合物在0ºC下攪拌40分鐘，然後在室溫下攪拌2小時。添加硫代硫酸鈉水溶液（10 ml）和1N NaOH水溶液（10 ml），並且將水層用二氯甲烷萃取三次。將合併的有機相經硫酸鈉乾燥，過濾並在減壓下蒸發，以提供5-溴-3-乙基磺醯基-吡啶-2-甲酸三級丁酯（化合物I33）。將粗材料不經進一步純化而用於下一步驟。^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 1.35 (t, 3H,) 1.65 (s, 9H), 3.53 (q, 2H), 8.45 (d, 1H), 8.87 (d, 1H)。

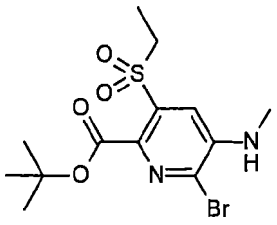
步驟3：3-乙基磺醯基-5-(甲基胺基)吡啶-2-甲酸三級丁酯（化合物I34）的製備



(I34)

【0259】 向小瓶中裝入5-溴-3-乙基磺醯基-吡啶-2-甲酸三級丁酯（1.3 g，3.7 mmol）、四氫呋喃（4 mL）、甲胺（40%，在水中）和銅粉（0.2當量，0.74 mmol）。將容器密封，並且將混合物在100ºC下加熱8小時。將反應混合物用水淬滅，並且將水層用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機相經硫酸鈉乾燥，過濾並在減壓下濃縮，以提供3-乙基磺醯基-5-(甲基胺基)吡啶-2-甲酸三級丁酯（化合物I34）。將粗材料不經進一步純化而用於下一步驟。^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 1.37 (t, 3H), 1.63 (s, 9H), 2.94 (s, 3H), 3.59 (q, 2H), 7.27 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 8.3 (br s, 1H)。

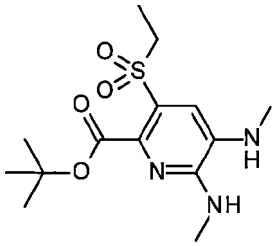
步驟4：6-溴-3-乙基磺醯基-5-(甲基胺基)吡啶-2-甲酸三級丁酯（化合物I35）的製備



(I35)

【0260】 將N-溴代琥珀醯亞胺（1.1當量，3.66 mmol）加入無水N,N-二甲基甲醯胺（10 mL）中的3-乙基磺醯基-5-(甲基胺基)吡啶-2-甲酸三級丁酯（1.0 g，3.33 mmol）的溶液中，並且將反應混合物在室溫下攪拌2小時。添加水，並且將產物用乙酸乙酯萃取兩次。將合併的有機層用水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並在減壓下蒸發，以提供6-溴-3-乙基磺醯基-5-(甲基胺基)吡啶-2-甲酸三級丁酯（化合物I35）。將粗材料不經進一步純化而用於下一步驟。^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 1.35 (t, 3H), 1.63 (s, 9H), 3.00 (s, 3H), 3.57 (q, 2H), 5.0 (br s, 1H), 7.28 (s, 1H)。

步驟5：3-乙基磺醯基-5,6-雙(甲基胺基)吡啶-2-甲酸三級丁酯（化合物I36）的製備

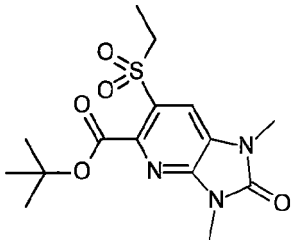


(I36)

【0261】 向無水四氫呋喃（8 mL）中的6-溴-3-乙基磺醯基-5-(甲基胺基)吡啶-2-甲酸三級丁酯（800 mg，2.64 mmol）的溶液中添加甲胺溶液（2M，在THF中，2 mL，4 mmol）。將容器密封，並且將混合物在100°C下攪拌7小時。反應完成後，將溶劑在減壓下蒸發，將殘餘物用水稀釋，並且將產物用乙酸乙酯萃取兩次。將合併的有機層用鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並在減壓下蒸發，以提供3-乙基磺醯基-5,6-雙(甲基胺基)吡啶-2-甲酸三級丁酯（化合物I36）。將粗材料不經進一步純化而用於下一步驟。^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm

1.32 (t, 3H), 1.63 (s, 9H), 2.86 (s, 3H), 3.04 (s, 3H), 3.40 (q, 2H), 4.76 (br s, 1H), 7.06 (s, 1H)。

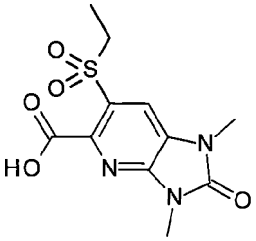
步驟6：6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-2-側氧基-咪唑并[4,5-b]吡啶-5-甲酸三級丁酯（化合物I37）的製備



(I37)

【0262】 在0ºC下，將三光氣（1.2當量，2.44 mmol）加入無水四氫呋喃（20 mL）中的3-乙基磺醯基-5,6-雙(甲基胺基)吡啶-2-甲酸三級丁酯（670 mg，2.03 mmol）和三乙胺（3.0當量，6.10 mmol）的溶液中。將反應混合物在0ºC下攪拌一小時，然後在室溫下攪拌2小時。將反應混合物用水淬滅並用二氯甲烷萃取。將合併的有機層用水和鹽水洗滌，經無水硫酸鈉乾燥並在減壓下濃縮。將殘餘物藉由管柱層析（乙酸乙酯/己烷8：2）純化，以提供6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-2-側氧基-咪唑并[4,5-b]吡啶-5-甲酸三級丁酯（化合物I37）。^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 1.33 (t, 3H), 1.66 (s, 9H), 3.48 (q, 2H), 3.50 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 7.68 (s, 1H)。

步驟7：6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-2-側氧基-咪唑并[4,5-b]吡啶-5-甲酸（化合物I38）的製備

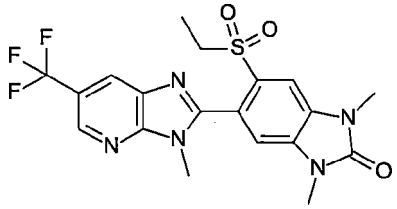


(I38)

【0263】 將2,2,2-三氟乙酸（0.40 g，3.5 mmol）加入無水二氯甲烷（2 mL）中的6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-2-側氧基-咪唑并[4,5-b]吡啶-5-甲酸三級丁酯（化合物I37）（250 mg，0.70 mmol）的溶液中。將反應混合物在室溫下攪拌3小時，然後在減壓下濃縮至乾，以提供6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-2-側氧基-咪唑并[4,5-b]吡啶-5-甲酸（化合物I38）。LCMS（方法4）：298 $(M-H)^-$；保留時間：0.31 min。^{1}H NMR (400 MHz, d_6-DMSO) δ ppm 1.19 (t, 3H), 3.38 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.49 (q, 2H), 7.92 (s, 1H)

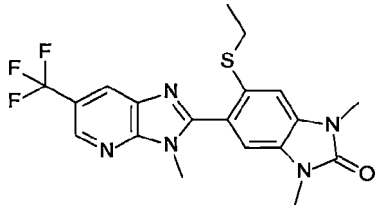
b) 具有式 (I) 之化合物的實施例的合成：

實施例P3：5-乙基磺醯基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮（化合物P3）的製備：



(P3)

步驟1：5-乙基氫硫基-1,3-二甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P12）的製備

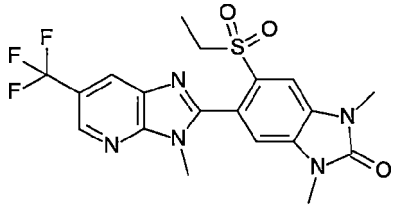


(P12)

【0264】 將甲基碘（709 μL，11.4 mmol，1.10當量）逐滴加入N,N-二甲基甲醯胺（20 mL）中的5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮（4.22 g，10.4 mmol，1.00當量，上文製備的化合物I5）和碳酸銫（6.76 g，20.7 mmol，2.00當量）的混合物中。在室溫下攪拌2小時後，將反應混合物用水淬滅，並且將水相用乙酸乙酯萃取三次。將合併的

有機相用鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）純化，提供所需產物。LCMS（方法4）：422 $(M+H)^+$；保留時間：1.05 min。

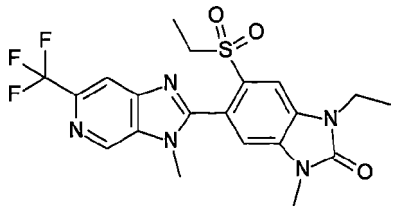
步驟2：5-乙基磺醯基-1,3-二甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P3）的製備



(P3)

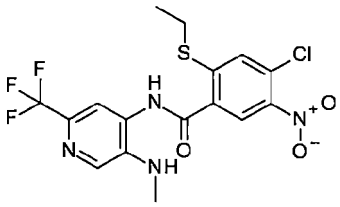
【0265】 將70%質量的3-氯過苯甲酸（4.22 g，17.1 mmol，2.20當量）分批加入二氯甲烷（100 mL）中的5-乙基氫硫基-1,3-二甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（3.30 g，7.83 mmol，1.00當量，上文製備的化合物P12）的0ºC冷卻溶液中。在室溫下攪拌2小時後，將反應混合物用10%碳酸鉀溶液緩慢淬滅，將有機相用水、鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）純化，提供所需化合物。LCMS（方法4）：454 $(M+H)^+$；保留時間：0.91 min。

實施例P4：1-乙基-6-乙基磺醯基-3-甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P4）的製備：



(P4)

步驟1：4-氯-2-乙基氫硫基-N-[5-(甲基胺基)-2-(三氟甲基)-4-吡啶基]-5-硝基-苯甲醯胺（化合物I6）的製備

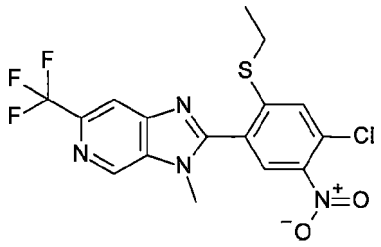


(I6)

【0266】 向還含有1滴N,N-二甲基甲醯胺的二氯甲烷（50 mL）中的4-氯-2-乙基氫硫基-5-硝基-苯甲酸（5.00 g，19.1 mmol，1.00當量，根據WO 2016091731製備）的0°C冷卻溶液中逐滴添加草醯氯（3.06 mL，34.4 mmol，1.80當量）。在0°C下攪拌2 h後，將反應混合物在減壓下濃縮並且將粗材料直接使用。

【0267】 將四氫呋喃（20 mL）中的4-氯-2-乙基氫硫基-5-硝基-苯甲醯氯（19.1 mmol，1.00當量，上文獲得的）的溶液緩慢加入乙酸乙酯（50 mL）中的N3-甲基-6-(三氟甲基)吡啶-3,4-二胺（4.38 g，22.9 mmol，1.20當量，如WO 2016005263中所述製備）和三乙胺（6.73 mL，47.8 mmol，2.50當量）的預攪拌溶液中。在添加完成後，將反應在室溫下攪拌1小時。然後將混合物在減壓下濃縮，並且將粗材料不經進一步純化而用於下一步驟。LCMS（方法1）：435/437 $(M+H)^+$；保留時間：0.97 min。

步驟2：2-(4-氯-2-乙基氫硫基-5-硝基-苯基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶（化合物I7）的製備

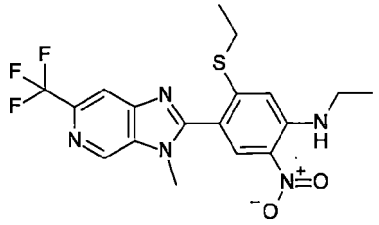


(I7)

【0268】 將乙酸（125 mL）中的4-氯-2-乙基氫硫基-N-[5-(甲基胺基)-2-(三氟甲基)-4-吡啶基]-5-硝基-苯甲醯胺（10.0 g，23.0 mmol，上文製備的化合物I6）的溶液回流5小時。冷卻至室溫後，將反應混合物直接蒸發。將粗材料在甲醇中研磨以提供呈黃色固體的所需產物。將產物不經純化而用於下一步驟。LCMS

（方法1）：417/419 $(M+H)^+$；保留時間：1.06 min。

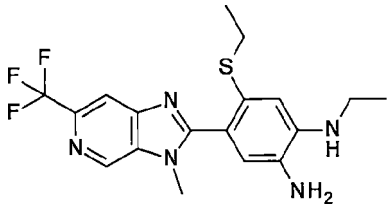
步驟3：N-乙基-5-乙基氫硫基-4-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-2-硝基-苯胺（化合物I8）的製備



(I8)

【0269】 將乙胺溶液（2.0 mol/L，在四氫呋喃中，6.0 mL，12.0 mmol，10.0當量）中的2-(4-氯-2-乙基氫硫基-5-硝基-苯基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶（500 mg，1.20 mmol，上文製備的化合物I7）的溶液回流2小時。冷卻至室溫後，將反應混合物過濾，將固體用乙酸乙酯洗滌，並且將所得濾液在減壓下濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）直接純化，以提供呈黃色固體的所需產物。LCMS（方法1）：426 $(M+H)^+$；保留時間：1.05 min。

步驟4：N2-乙基-4-乙基氫硫基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯-1,2-二胺（化合物I9）的製備

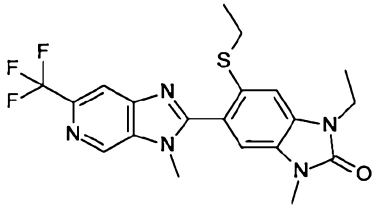


(I9)

【0270】 將乙醇（15 mL）中的N-乙基-5-乙基氫硫基-4-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-2-硝基-苯胺（459 mg，1.08 mmol，上文製備的化合物I8）的溶液抽空並用氬氣回填，之後添加Pd/C 10%（459 mg，0.43 mmol，0.4當量）。將混合物再次抽空並用氬氣回填，然後用氫氣回填，並且然後在氫壓

下（用氣球）在室溫下攪拌6小時。抽空並用氬氣吹掃後，將所得混合物通過矽藻土過濾，將過濾器用乙酸乙酯洗滌，並且將獲得的濾液在減壓下濃縮。藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）純化，提供所需產物。LCMS（方法1）：396 $(M+H)^+$；保留時間：0.96 min。

步驟5：1-乙基-6-乙基氫硫基-3-甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P1）的製備



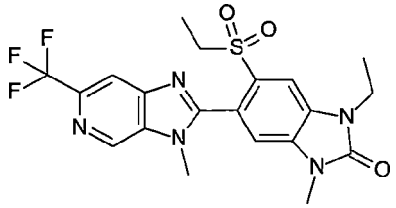
(P1)

【0271】 將乙酸（15 mL）中的N2-乙基-4-乙基氫硫基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯-1,2-二胺（340 mg，0.86 mmol，1.00當量，上文製備的化合物I9）和四甲氧基甲烷（128 μL，0.95 mmol，1.10當量）的溶液在80℃下加熱並攪拌3小時。冷卻至室溫後，將反應混合物在真空下濃縮。將殘餘物在乙酸乙酯中稀釋，將有機相用飽和碳酸氫鈉溶液洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）純化，以提供3-乙基-5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮和2-(1-乙基-6-乙基氫硫基-2-甲氧基-苯并咪唑-5-基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶的混合物，將其直接用於下一步驟。

【0272】 將上文獲得的混合物溶於N,N-二甲基甲醯胺（5.0 mL）中，並且添加碳酸銫（332 mg，1.72 mmol，2.00當量），隨後添加甲基碘（59 μL，0.95 mmol，1.10當量）。在室溫下攪拌過夜後，將反應混合物傾倒入水中，並且將水相用乙酸乙酯萃取。將合併的有機相經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）純化，以給出所需產物。LCMS（方法

1）：436 $(M+H)^+$；保留時間：0.95 min。

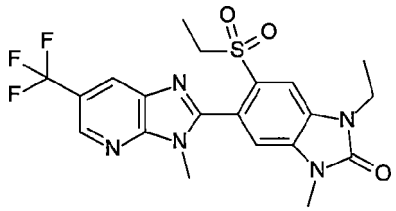
步驟6：1-乙基-6-乙基磺醯基-3-甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P4）的製備



(P4)

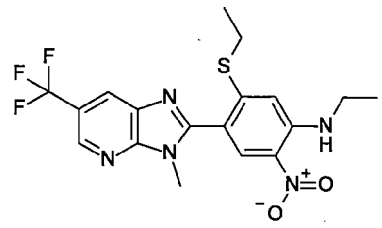
【0273】 將70%質量的3-氯過苯甲酸（132 mg，0.57 mmol，2.10當量）分批加入二氯甲烷（5.0 mL）中的1-乙基-6-乙基氫硫基-3-甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（119 mg，0.27 mmol，1.00當量，上文製備的化合物I10）的0ºC冷卻溶液中。在室溫下攪拌2小時後，將反應混合物用飽和硫代硫酸鈉溶液緩慢淬滅，將有機相用1M氫氧化鈉溶液洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）純化，提供所需化合物。LCMS（方法1）：468 $(M+H)^+$；保留時間：0.86 min。

實施例P5：1-乙基-6-乙基磺醯基-3-甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P5）的製備：



(P5)

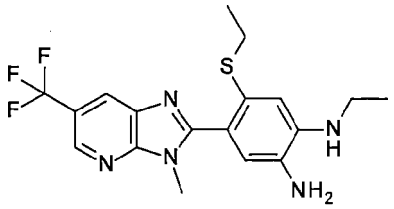
步驟1：N-乙基-5-乙基氫硫基-4-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-2-硝基-苯胺（化合物I11）的製備



(I11)

【0274】 將乙胺溶液（2.0 mol/L，在四氫呋喃中，20 mL，40.0 mmol，4.17當量）中的2-(4-氯-2-乙基氫硫基-5-硝基-苯基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶（4.00 g，9.60 mmol，化合物I2，如上文實施例P1步驟2中所述製備）的溶液在80ºC下加熱3小時。添加更多的乙胺溶液（80 mL，160 mmol，20.8當量）以完成反應。冷卻至室溫後，將反應混合物在減壓下濃縮。將材料再次溶於乙酸乙酯中，將有機相用水、鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）純化，以提供所需產物。LCMS（方法4）：426 $(M+H)^+$；保留時間：1.22 min。

步驟2：N2-乙基-4-乙基氫硫基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯-1,2-二胺（化合物I12）的製備

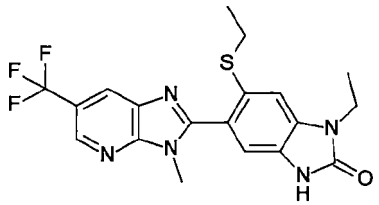


(I12)

【0275】 將乙酸乙酯（50 mL）、甲醇（100 mL）和四氫呋喃（10 mL）的混合物中的N-乙基-5-乙基氫硫基-4-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-2-硝基-苯胺（1.70 g，4.00 mmol，上文製備的化合物I11）的溶液抽空並用氮氣回填，之後添加Pd/C 10%（210 mg，0.20 mmol，0.05當量）。將混合物再次抽空並用氮氣回填，然後用氫氣回填，並在氫壓下（用氣球）在室溫下攪拌6小時。抽空並用氮氣吹掃後，將所得混合物通過矽藻土過濾，並且將獲得的濾液在減壓下濃縮。將粗材料不經進一步純化而直接用於下一步驟。LCMS（方法

4）：396 $(M+H)^+$；保留時間：1.05 min。

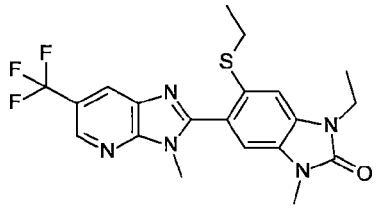
步驟3：3-乙基-5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮（化合物I13）的製備



(I13)

【0276】 將甲苯中的光氣的20% wt溶液（2.3 mL，2.2 g，4.5 mmol，1.1當量）逐滴加入二氯甲烷（100 mL）中的粗N2-乙基-4-乙基氫硫基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯-1,2-二胺（1.6 g，4.0 mmol，1.00當量，上文製備的化合物I12）和三乙胺（1.7 mL，12 mmol，3.0當量）的0℃冷卻溶液中。在0℃下攪拌1小時並在室溫下進一步攪拌後，將反應混合物用二氯甲烷稀釋並用水緩慢淬滅。將水相用二氯甲烷萃取，將合併的有機相用水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）純化，以提供所需化合物。LCMS（方法4）：422 $(M+H)^+$；保留時間：0.99 min。

步驟4：1-乙基-6-乙基氫硫基-3-甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P2）的製備

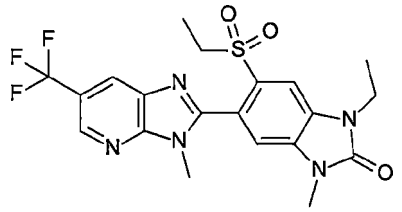


(P2)

【0277】 將甲基碘（194 μL，3.11 mmol，1.20當量）逐滴加入N,N-二甲基甲醯胺（40 mL）中的3-乙基-5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮（1.09 g，2.59 mmol，1.00當量，上文製備的化合

物I13）和碳酸銫（2.53 g，7.76 mmol，3.00當量）的混合物中。在室溫下攪拌2小時後，將反應混合物用水淬滅，並且將水相用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機相用鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）純化，提供所需產物。LCMS（方法4）：436 $(M+H)^+$；保留時間：1.06 min。

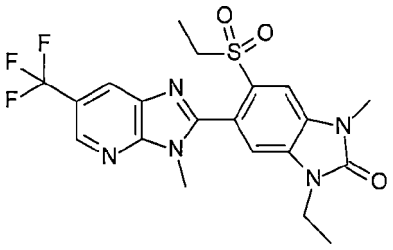
步驟5：1-乙基-6-乙基磺醯基-3-甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P5）的製備



(P5)

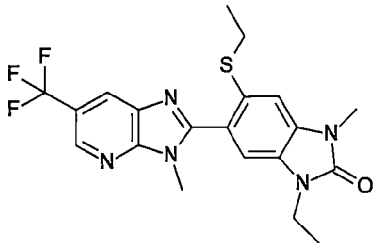
【0278】 將70%質量的3-氯過苯甲酸（1.09 g，3.79 mmol，2.20當量）分批加入二氯甲烷（100 mL）中的1-乙基-6-乙基氫硫基-3-甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（750 mg，1.72 mmol，1.00當量，上文製備的化合物P2）的0°C冷卻溶液中。在室溫下攪拌過夜後，將反應混合物用水緩慢淬滅，用二氯甲烷和飽和碳酸氫鈉溶液稀釋。攪拌10 min後，將水相用二氯甲烷萃取兩次。將合併的有機相用飽和碳酸氫鈉溶液、1N氫氧化鉀溶液洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）純化，隨後從乙醇中重結晶，提供呈白色固體的所需化合物。LCMS（方法4）：468 $(M+H)^+$；保留時間：0.95 min。

實施例P6：1-乙基-5-乙基磺醯基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P6）的製備：



(P6)

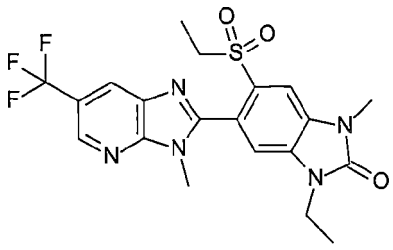
步驟1：1-乙基-5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P7）的製備



(P7)

【0279】 將乙基碘（440 μL，5.4 mmol，1.10當量）逐滴加入N,N-二甲基甲醯胺（20 mL）中的5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮（2.0 g，4.9 mmol，1.00當量，上文製備的化合物I5）和碳酸銫（3.2 g，9.8 mmol，2.00當量）的混合物中。在室溫下攪拌2小時後，將反應混合物用水淬滅，並且將水相用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機相用鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）純化，提供所需產物。LCMS（方法4）：436 $(M+H)^+$；保留時間：1.08 min。

步驟2：1-乙基-5-乙基磺醯基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P6）的製備

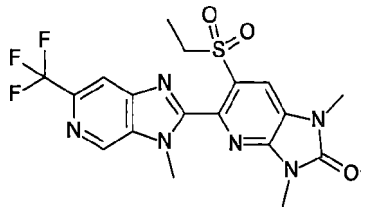


(P6)

【0280】 將70%質量的3-氯過苯甲酸（1.9 g，7.6 mmol，2.20當量）分批

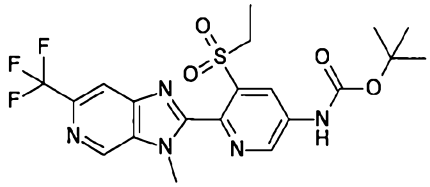
加入二氯甲烷（50 mL）中的1-乙基-5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（1.5 g，3.4 mmol，1.00當量，上文製備的化合物P7）的0°C冷卻溶液中。在室溫下攪拌2小時後，將反應混合物用20%氫氧化鈉溶液緩慢淬滅，將有機相用水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）純化，提供所需化合物。LCMS（方法4）：468 $(M+H)^+$；保留時間：0.94 min。

實施例P8：6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]咪唑并[4,5-b]吡啶-2-酮（化合物P8）的製備：



(P8)

步驟1：N-[5-乙基磺醯基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]胺基甲酸三級丁酯（化合物I15）的製備

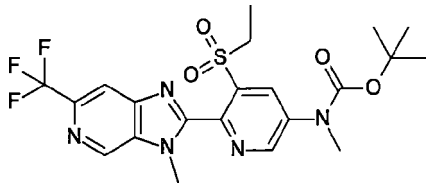


(I15)

【0281】 向1,4-二噁烷（100 mL）中的2-(5-溴-3-乙基磺醯基-2-吡啶基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶（7 g，15.6 mmol，1.00當量，如WO 2016/026848中所述製備）的溶液中依次添加胺基甲酸三級丁酯（2.19 g，18.7 mmol，1.2當量）、碳酸銫（7.11 g，21.8 mmol，1.4當量）和XPHOS（1.36 g，2.81 mmol，0.18當量）。用氬氣將反應混合物脫氣30 min後，添加乙酸鈀（212 mg，0.94 mmol，0.06當量）。再脫氣30 min後，將反應混合物在110°C下加熱過夜。將反應混合物冷卻至室溫並傾倒入鹽水中。將水相用乙酸乙酯萃取三次，將合併的有機相用鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料不經純化而直

接用於下一步驟。LCMS（方法4）：486 $(M+H)^+$；保留時間：1.08 min。

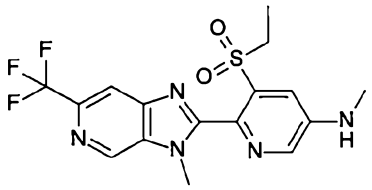
步驟2：N-[5-乙基磺醯基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-胺基甲酸三級丁酯（化合物I16）的製備



(I16)

【0282】 向N,N-二甲基甲醯胺（40 mL）中的粗N-[5-乙基磺醯基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]胺基甲酸三級丁酯（5.00 g，10.3 mmol，上文製備的化合物I15）的溶液中加入碳酸鉀（1.71 g，12.4 mmol，1.20當量），隨後添加甲基碘（770 μL，12.4 mmol，1.20當量）。在室溫下攪拌過夜後，將反應混合物傾倒入水中，並且將水相用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機相用鹽水洗滌三次，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。粗材料的純度足以不經純化而參與下一步驟。LCMS（方法4）：500 $(M+H)^+$；保留時間：1.03 min。

步驟3：5-乙基磺醯基-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺（化合物I17）的製備

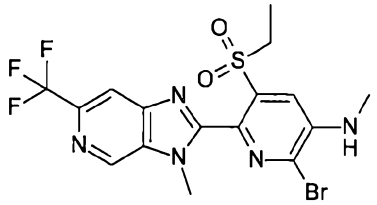


(I17)

【0283】 將三氟乙酸（7.7 mL，100 mmol，10.0當量）逐滴加入二氯甲烷（100 mL）中的粗N-[5-乙基磺醯基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-胺基甲酸三級丁酯（5.1 g，10.0 mmol，1.00當量，上文製備的化合物I16）的溶液中。在室溫下攪拌過夜後，將反應混合物濃縮。將粗材料用飽和碳酸鉀溶液小心地中和，並且將水相用二氯甲烷萃取五次。將合併的

有機相經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。粗材料的純度足以不經純化而參與下一步驟。LCMS（方法3）：400 $(M+H)^+$；保留時間：1.48 min。

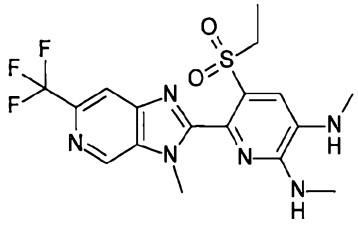
步驟4：2-溴-5-乙基磺醯基-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺（化合物I18）的製備



(I18)

【0284】 將N-溴代琥珀醯亞胺（2.6 g，14.4 mmol，1.20當量）分四等份加入N,N-二甲基甲醯胺（50 mL）中的粗5-乙基磺醯基-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺（4.9 g，12.0 mmol，1.00當量，上文製備的化合物I17）的溶液中。在室溫下攪拌4小時後，將反應混合物倒入水（100 mL）中。大部分產物從混合物中沈澱出來。過濾提供所需材料，純度足以直接參與下一步驟。LCMS（方法3）：478/480 $(M+H)^+$；保留時間：1.48 min。

【0285】 步驟5：5-乙基磺醯基-N2,N3-二甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-2,3-二胺（化合物I19）的製備

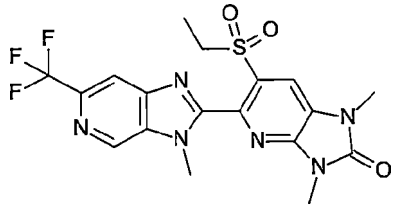


(I19)

【0286】 將甲胺溶液（2.0M，在四氫呋喃中，3.3 mL，6.60 mmol，7.86當量）中的粗2-溴-5-乙基磺醯基-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺（400 mg，0.84 mmol，上文製備的化合物I18）的溶液在壓力容器中在100°C下加熱3小時。冷卻至室溫後，將反應混合物傾倒入水中，並且將水相用乙酸乙酯萃取。將合併的有機相用水、鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過

濾並濃縮。粗材料的純度足以直接參與下一步驟。LCMS（方法4）：429 $(M+H)^+$；保留時間：0.93 min。

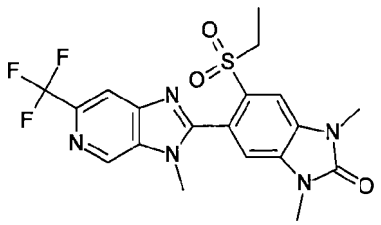
步驟6：6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]咪唑并[4,5-b]吡啶-2-酮（化合物P8）的製備



(P8)

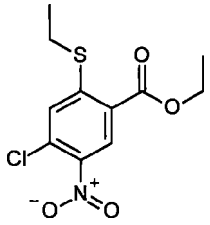
【0287】 將甲苯中的光氣的20% wt溶液（487 μL，450 mg，0.91 mmol，1.3當量）逐滴加入二氯甲烷（100 mL）中的粗5-乙基磺醯基-N2,N3-二甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-2,3-二胺（300 mg，0.70 mmol，1.00當量，上文製備的化合物I19）和三乙胺（585 μL，4.2 mmol，6.0當量）的0ºC冷卻溶液中。在0ºC下攪拌30 min並在室溫下進一步攪拌後，將反應混合物用水緩慢淬滅。將水相用二氯甲烷萃取，將合併的有機相用水、鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）純化，以提供所需化合物。LCMS（方法4）：455 $(M+H)^+$；保留時間：0.83 min。

實施例P9：5-乙基磺醯基-1,3-二甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P9）的製備：



(P9)

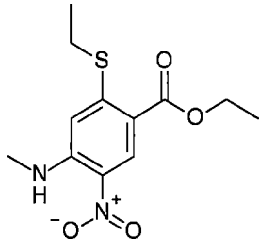
步驟1：4-氯-2-乙基氫硫基-5-硝基-苯甲酸乙酯（化合物I20）的製備



(I20)

【0288】 將濃硫酸(4.6 mL，84.8 mmol，3.00當量)逐滴加入乙醇(150 mL)中的4-氯-2-乙基氫硫基-5-硝基-苯甲酸（10.0 g，28.3 mmol，1.00當量，根據WO 2016091731製備）的溶液中。將反應混合物加熱至回流並攪拌過夜。冷卻至室溫後，將反應混合物在減壓下濃縮，並且將殘餘物用水稀釋。將水相用乙酸乙酯萃取三次，將合併的有機相用飽和碳酸氫鈉溶液、水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。粗材料的純度足以直接參與下一步驟。LCMS（方法3）：290/292 $(M+H)^+$；保留時間：1.62 min。

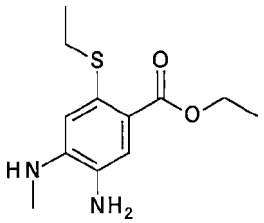
步驟2：2-乙基氫硫基-4-(甲基胺基)-5-硝基-苯甲酸乙酯（化合物I21）的製備



(I21)

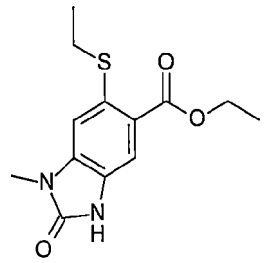
【0289】 在劇烈攪拌下，將甲胺溶液（2.0M，在四氫呋喃中，155 mL，310 mmol，3.00當量）小心地加入四氫呋喃（80 mL）中的粗4-氯-2-乙基氫硫基-5-硝基-苯甲酸乙酯（30.0 g，104 mmol，上文製備的化合物I20）的溶液中。在室溫下攪拌2小時後，將反應混合物在減壓下濃縮。將殘餘物在二氯甲烷（200 mL）和氯仿（100 mL）的混合物中稀釋。將有機相用水（500 mL）洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。粗材料的純度足以直接參與下一步驟。LCMS(方法4)：285 $(M+H)^+$；保留時間：1.12 min。

步驟3：5-胺基-2-乙基氫硫基-4-(甲基胺基)苯甲酸乙酯（化合物I22）的製備


(I22)

【0290】 將甲醇（35 mL）中的2-乙基氫硫基-4-(甲基胺基)-5-硝基-苯甲酸乙酯（2.75 g，9.67 mmol，上文製備的化合物I21）的溶液抽空並用氮氣回填，之後添加Pd/C 10%（300 mg，0.28 mmol，0.03當量）。將混合物再次抽空並用氮氣回填，然後用氫氣回填，並在氫壓下（用氣球）在室溫下攪拌4.5小時。抽空並用氮氣吹掃後，將所得混合物通過矽藻土過濾，並且將獲得的濾液在減壓下濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）純化，以提供所需材料。LCMS（方法4）：255 $(M+H)^+$；保留時間：0.83 min。

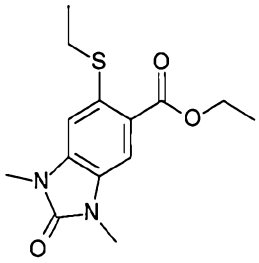
步驟4：6-乙基氫硫基-1-甲基-2-側氧基-3H-苯并咪唑-5-甲酸乙酯（化合物I23）的製備


(I23)

【0291】 將甲苯中的光氣的20% wt溶液（1.37 mL，1.26 g，2.66 mmol，1.33當量）逐滴加入二氯甲烷（75 mL）中的5-胺基-2-乙基氫硫基-4-(甲基胺基)苯甲酸乙酯（500 mg，2.00 mmol，1.00當量，上文製備的化合物I22）和三乙胺（1.64 mL，11.8 mmol，5.90當量）的0°C冷卻溶液中。在0°C下攪拌1小時後，將反應混合物用水緩慢淬滅。將水相用二氯甲烷萃取，將合併的有機相用水、鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）純化，以提供呈白色固體的所需化合物。LCMS（方法4）：

281 $(M+H)^+$；保留時間：0.85 min。

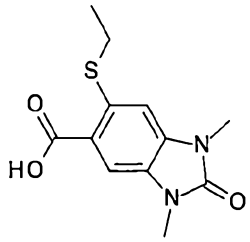
步驟5：6-乙基氫硫基-1,3-二甲基-2-側氧基-苯并咪唑-5-甲酸乙酯（化合物I24）的製備



(I24)

【0292】 向N,N-二甲基甲醯胺（5.0 mL）中的6-乙基氫硫基-1-甲基-2-側氧基-3H-苯并咪唑-5-甲酸乙酯（100 mg，0.355 mmol，上文製備的化合物I23）的溶液中加入碳酸銫（349 mg，1.07 mmol，3.00當量），隨後添加甲基碘（44 μL，0.71 mmol，2.00當量）。在室溫下攪拌3小時後，將反應混合物傾倒入水中，並且將水相用乙酸乙酯萃取。將合併的有機相用水、鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）純化，提供所需化合物。LCMS（方法4）：295 $(M+H)^+$；保留時間：0.91 min。

步驟6：6-乙基氫硫基-1,3-二甲基-2-側氧基-苯并咪唑-5-甲酸（化合物I25）的製備

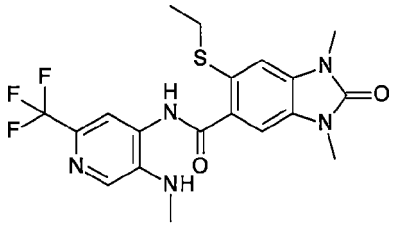


(I25)

【0293】 將氫氧化鈉（81 mg，2.04 mmol，6.00當量）加入四氫呋喃（10 mL）和水（1.0 mL）中的6-乙基氫硫基-1,3-二甲基-2-側氧基-苯并咪唑-5-甲酸乙酯（100 mg，0.34 mmol，上文製備的化合物I24）的溶液中。將反應混合物加熱

至回流並攪拌2小時。冷卻至室溫後，將反應混合物傾倒入2N鹽酸溶液中，並且將水相用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機相用鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。粗材料直接參與下一步驟。LCMS（方法4）：267 $(M+H)^+$；保留時間：0.69 min。

步驟7：6-乙基氫硫基-1,3-二甲基-N-[5-(甲基胺基)-2-(三氟甲基)-4-吡啶基]-2-側氧基-苯并咪唑-5-甲醯胺（化合物I26）的製備

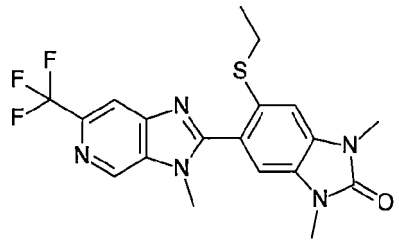


(I26)

【0294】 向還含有一滴N,N-二甲基甲醯胺的二氯甲烷（12 mL）中的6-乙基氫硫基-1,3-二甲基-2-側氧基-苯并咪唑-5-甲酸（600 mg，2.25 mmol，1.00當量，上文製備的化合物I25）的0℃冷卻溶液中添加草醯氯（238 μL，2.70 mmol，1.20當量）。在室溫下攪拌1.5小時後，將反應混合物在減壓下濃縮並且將粗材料直接使用。

【0295】 將二氯甲烷（12 mL）中的6-乙基氫硫基-1,3-二甲基-2-側氧基-苯并咪唑-5-碳醯氯（641 mg，2.25 mmol，1.00當量，上文獲得的）的懸浮液緩慢加入二氯甲烷（12 mL）中的N3-甲基-6-(三氟甲基)吡啶-3,4-二胺（430 mg，2.25 mmol，1.00當量，如WO 2016005263中所述製備）和三乙胺（1.88 mL，13.5 mmol，6.00當量）的0℃冷卻且預攪拌溶液中。在添加完成後，將反應混合物在室溫下攪拌2小時。然後將混合物傾倒在水上，並且將水相用二氯甲烷萃取。將合併的有機相經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料不經進一步純化而用於下一步驟。LCMS（方法4）：440 $(M+H)^+$；保留時間：0.87 min。

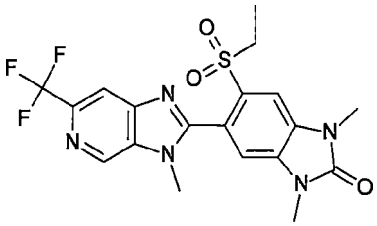
步驟8：5-乙基氫硫基-1,3-二甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P10）的製備



(P10)

【0296】 將乙酸（10 mL）中的4 6-乙基氫硫基-1,3-二甲基-N-[5-(甲基胺基)-2-(三氟甲基)-4-吡啶基]-2-側氧基-苯并咪唑-5-甲醯胺（650 mg，1.54 mmol，上文製備的化合物I26）的溶液在150ºC下在微波小瓶中加熱並攪拌1小時。冷卻至室溫後，將反應混合物傾倒入水中，並且將水相用二氯甲烷萃取。將合併的有機相經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的乙酸乙酯洗提）純化，提供呈白色固體的所需化合物。LCMS（方法4）：422 $(M+H)^+$；保留時間：0.93 min。

步驟9：5-乙基磺醯基-1,3-二甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P9）的製備

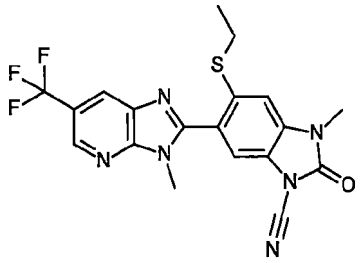


(P9)

【0297】 將70%質量的3-氯過苯甲酸（322 mg，1.31 mmol，2.20當量）分批加入二氯甲烷（20 mL）中的5-乙基氫硫基-1,3-二甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（250 mg，0.59 mmol，1.00當量，上文製備的化合物P10）的0ºC冷卻溶液中。在室溫下攪拌2小時後，將反應混合物用10%碳酸鉀溶液緩慢淬滅。將水相用二氯甲烷萃取，將合併的有機相用水、鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將粗材料藉由矽膠快速層析（用環己烷中的

乙酸乙酯洗提）純化，提供所需化合物。LCMS（方法4）：454 $(M+H)^+$；保留時間：0.73 min。

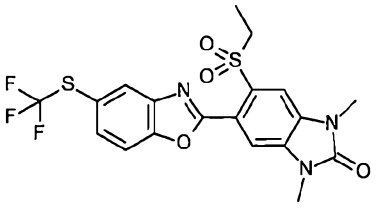
實施例P15：5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-2-側氧基-苯并咪唑-1-甲腈（化合物P15）的製備：



(P15)

【0298】 在0°C下，向N,N-二甲基甲醯胺（10 mL）中的5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮（上文製備的化合物I5）（300 mg，0.736 mmol）的溶液中添加氫化鈉（55%，38.6 mg，0.884 mmol）。將反應攪拌30分鐘，然後添加溴化氰（1.3當量，0.957 mmol）並且再繼續攪拌一小時。將反應混合物傾倒入冷水中，並且將水相用乙酸乙酯萃取兩次。將合併的有機相用鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並在減壓下濃縮。將殘餘物藉由矽膠快速層析（環己烷中的30%乙酸乙酯）純化，以提供呈固體的5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-2-側氧基-苯并咪唑-1-甲腈（化合物P15），mp 255°C-257°C。LCMS（方法4）：433 $(M+H)^+$；保留時間：1.06 min。

實施例P29：5-乙基磺醯基-1,3-二甲基-6-[5-(三氟甲基氫硫基)-1,3-苯并噁唑-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P29）的製備：

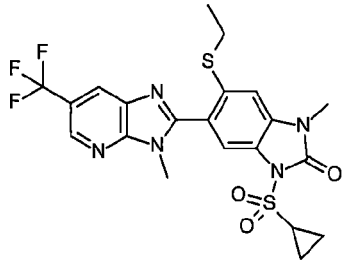


(P29)

【0299】 在0ºC下，向二氯甲烷（10.0 mL）中的5-乙基氫硫基-1,3-二甲基-6-[5-(三氟甲基氫硫基)-1,3-苯并噁唑-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P28）（400 mg，0.910 mmol）的溶液中添加間氯過氧苯甲酸（471 mg，70%，1.911 mmol，2.1當量），並且將混合物攪拌一小時。將反應混合物用2M氫氧化鈉水溶液淬滅，並且將水相用二氯甲烷萃取三次。將合併的有機相用鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將殘餘物藉由矽膠快速層析（環己烷中的30%乙酸乙酯）純化，以提供呈白色固體的5-乙基磺醯基-1,3-二甲基-6-[5-(三氟甲基氫硫基)-1,3-苯并噁唑-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P29），mp 234ºC-236ºC。LCMS（方法4）：472 $(M+H)^+$；保留時間：1.18 min。

【0300】 類似地，由二氯甲烷（10.0 mL）中的5-乙基氫硫基-1,3-二甲基-6-[5-(三氟甲基氫硫基)-1,3-苯并噁唑-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P28）（300 mg，0.683 mmol）和間氯過氧苯甲酸（724 mg，70%，2.935 mmol，4.3當量）獲得5-乙基磺醯基-1,3-二甲基-6-[5-(三氟甲基磺醯基)-1,3-苯并噁唑-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P25，白色固體，mp 216ºC-218ºC）。將反應混合物在室溫下攪拌16小時。化合物P25的LCMS（方法4）：504 $(M+H)^+$；保留時間：1.13 min。

實施例P30：1-環丙基磺醯基-5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮化合物P30）的製備：



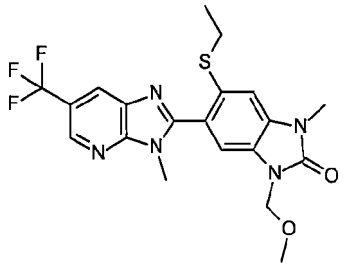
(P30)

【0301】 向四氫呋喃（4 mL）中的5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮（上文製備的化合物I5）（300 mg，0.736 mmol）的溶液中添加N-乙基二異丙胺（0.386 mL，2.209 mmol），隨

後逐滴添加環丙烷磺醯氯（0.0912 mL，0.884 mmol）。將反應混合物在室溫下攪拌12小時，傾倒入水中，並且將水相用二氯甲烷萃取三次。將合併的有機相用鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將殘餘物藉由矽膠快速層析（環己烷中的40%乙酸乙酯）純化，以提供呈固體的1-環丙基磺醯基-5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P30）。LCMS（方法4）：512 $(M+H)^+$；保留時間：1.08 min。

【0302】 類似地，由四氫呋喃（5 mL）中的5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮（上文製備的化合物I5）（200 mg，0.491 mmol）、N-乙基二異丙胺（0.257 mL，1.473 mmol）和環丙烷-碳醯氯（0.0546 mL，0.589 mmol）獲得1-(環丙烷羰基)-5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P33）。將反應混合物在室溫下攪拌4小時。化合物P33的LCMS（方法4）：476 $(M+H)^+$；保留時間：1.19 min。

實施例P31：5-乙基氫硫基-1-(甲氧基甲基)-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P31）的製備：



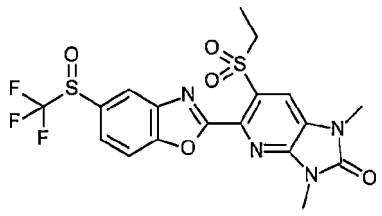
(P31)

【0303】 將N,N-二甲基甲醯胺（4 mL）中的5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮（上文製備的化合物I5）（300 mg，0.736 mmol）、碳酸銫（360 mg，1.105 mmol）和氯(甲氧基)甲烷（0.0883 mL，95%，1.105 mmol）的溶液在室溫下攪拌過夜。將反應混合物傾倒入水中，並且將水相用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機相用鹽水洗滌，

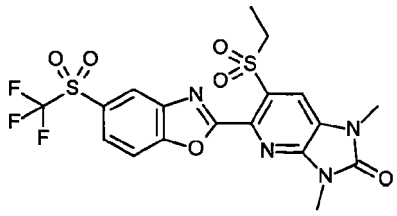
經硫酸鈉乾燥，過濾並在減壓下濃縮。將殘餘物藉由矽膠快速層析（環己烷中的40%乙酸乙酯）純化，以提供5-乙基氫硫基-1-(甲氧基甲基)-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮（化合物P31）。LCMS（方法4）：452 $(M+H)^+$；保留時間：1.04 min。

類似地，由N,N-二甲基甲醯胺（2.5 mL）中的5-乙基磺醯基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮（上文製備的化合物I10）（200 mg，0.455 mmol）、碳酸銫（223 mg，0.683 mmol）和氯(甲基氫硫基)-甲烷（0.0597 mL，96%，0.683 mmol）獲得6-乙基磺醯基-1-甲基-3-(甲基氫硫基甲基)-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮(化合物P17，固體，mp 214℃-216℃）。將反應混合物在室溫下攪拌5小時。化合物P17的LCMS（方法4）：500 $(M+H)^+$；保留時間：0.95 min。

【0304】 實施例P45：6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-5-[5-(三氟甲基亞磺醯基)-1,3-苯并噁唑-2-基]咪唑并[4,5-b]吡啶-2-酮(化合物P45)和6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-5-[5-(三氟甲基磺醯基)-1,3-苯并噁唑-2-基]咪唑并[4,5-b]吡啶-2-酮（化合物P26）的製備：



(P45)

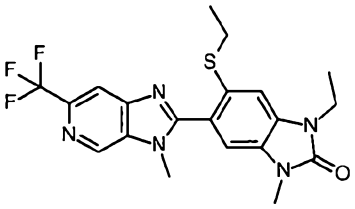
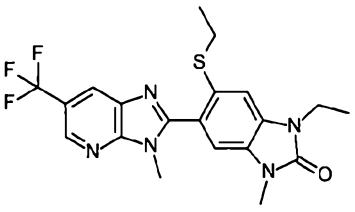
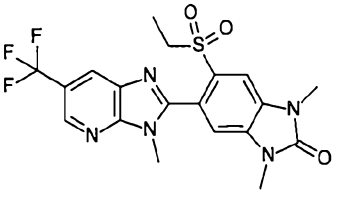
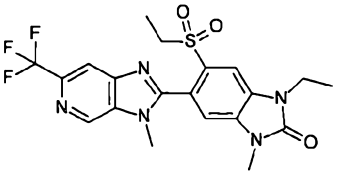


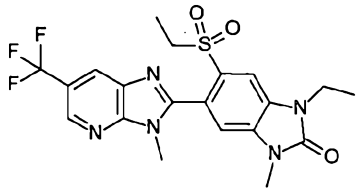
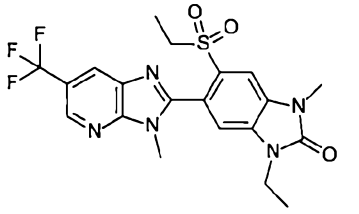
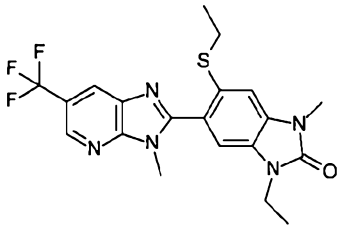
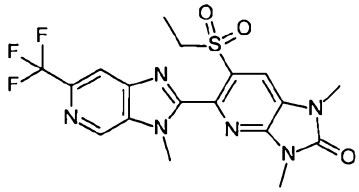
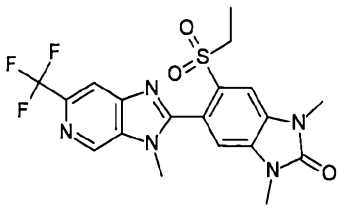
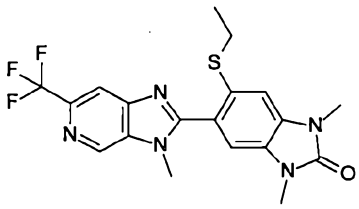
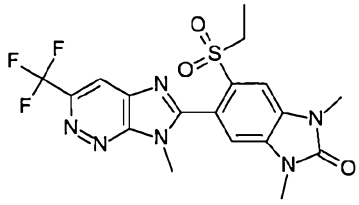
(P26)

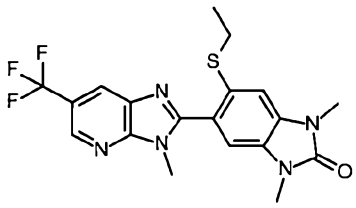
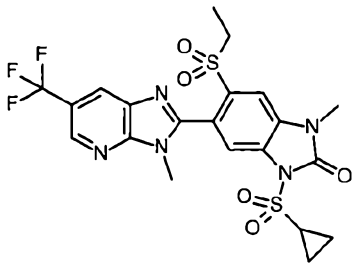
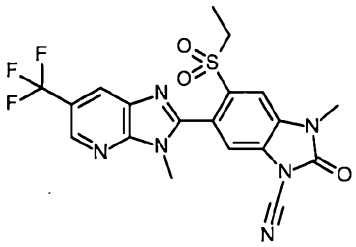
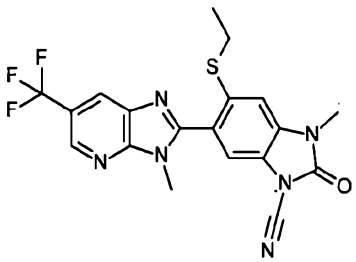
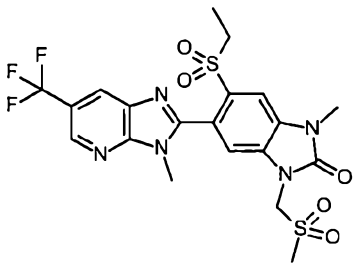
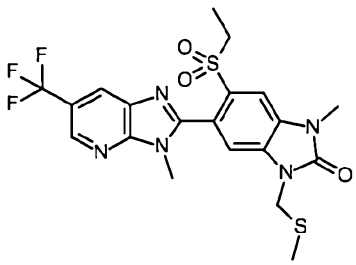
向在0°C的6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-5-[5-(三氟甲基氫硫基)-1,3-苯并噁唑-2-基]咪唑并[4,5-b]吡啶-2-酮（化合物P35）（50 mg，0.106 mmol）於二氯甲烷（1 mL）中的溶液中添加在0°C的間氯過氧苯甲酸（104 mg，70%，0.423 mmol），並且在室溫下攪拌該混合物持續24小時。將該反應混合物用2 M水性氫氧化鈉溶

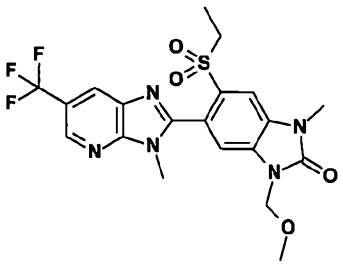
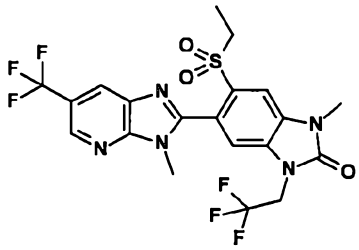
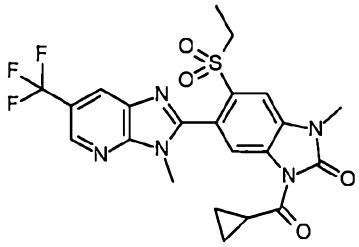
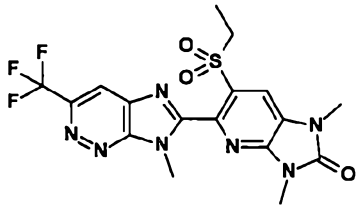
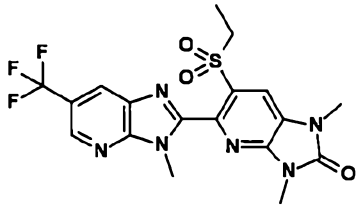
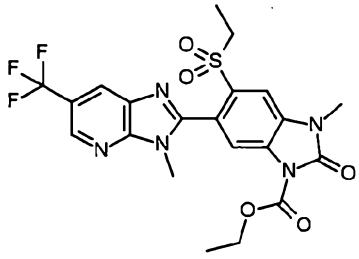
液淬滅，並且將水相用二氯甲烷萃取三次。將合併的有機相用鹽水洗滌，經硫酸鈉進行乾燥，過濾並進行濃縮。將殘餘物藉由矽膠快速層析（環己烷中的40%乙酸乙酯）純化，以提供呈固體的6-乙基-磺醯基-1,3-二甲基-5-[5-(三氟甲基磺醯基)-1,3-苯并噁唑-2-基]咪唑并[4,5-b]吡啶-2-酮（化合物P26）（20 mg，mp 247-249°C）以及呈固體的6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-5-[5-(三氟甲基-亞磺醯基)-1,3-苯并噁唑-2-基]咪唑并[4,5-b]吡啶-2-酮（化合物P45）（30 mg，mp 230-232°C）。LCMS化合物P26（方法4）：505 $(M+H)^+$；保留時間：1.03 min，以及LCMS化合物P45（方法4）：489 $(M+H)^+$；保留時間：0.95 min。

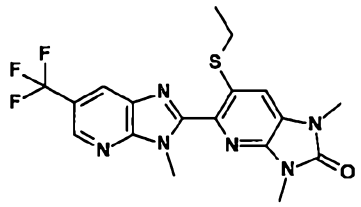
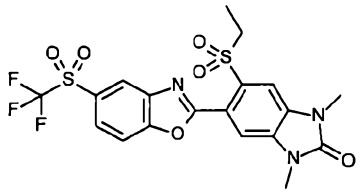
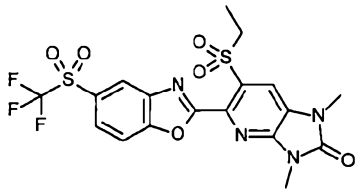
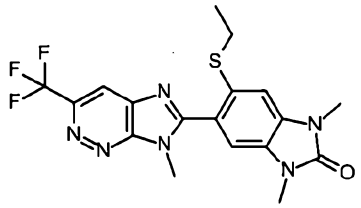
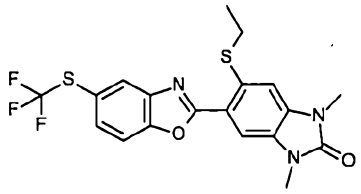
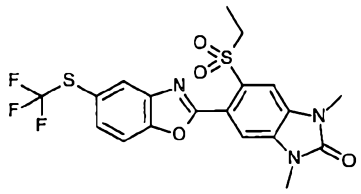
表P：具有式 (I)、I-a、I-b、IIa和II-b的化合物的實例

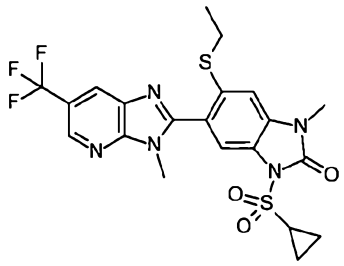
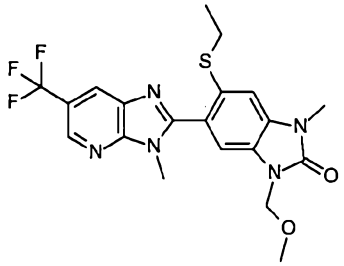
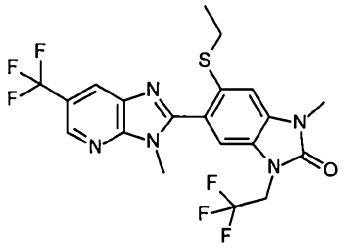
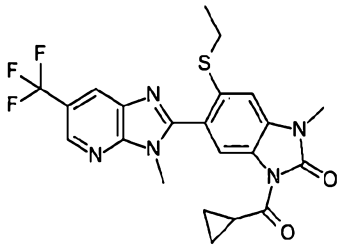
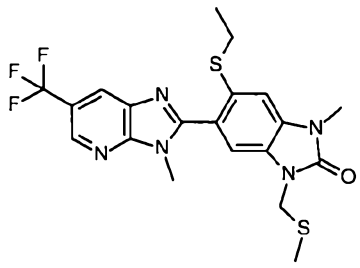
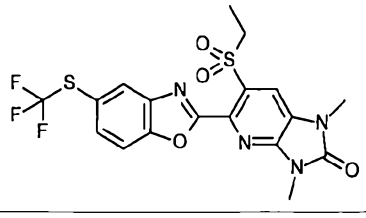
編號	IUPAC 名稱	結構	LCMS			Mp（°C）
			R_t（min）	$[M+H]^+$（測量的）	方法	
P1	1-乙基-6-乙基氫硫基-3-甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		0.95	436	1	
P2	1-乙基-6-乙基氫硫基-3-甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		1.06	436	4	186-188
P3	5-乙基磺醯基-1,3-二甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		0.91	454	4	213-215
P4	1-乙基-6-乙基磺醯基-3-甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		0.86	468	1	

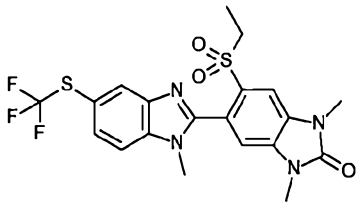
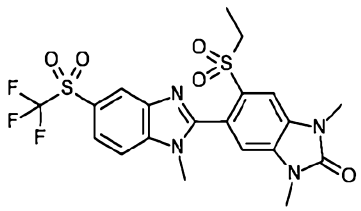
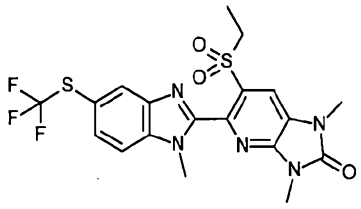
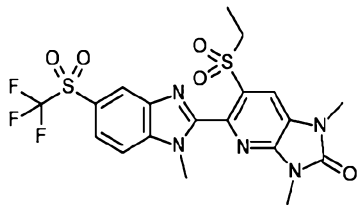
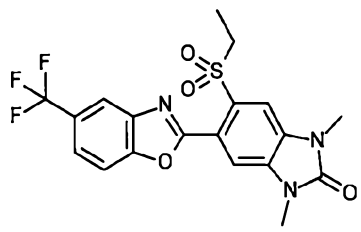
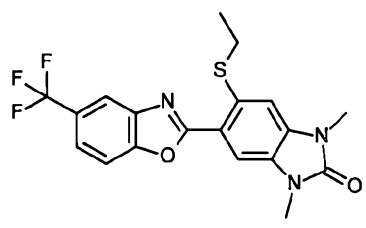
編號	IUPAC 名稱	結構	LCMS			Mp（℃）
			R_t（min）	$[M+H]^+$（測量的）	方法	
P5	1-乙基-6-乙基磺醯基-3-甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		0.95	468	4	218-220
P6	1-乙基-5-乙基磺醯基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		0.94	468	4	201-203
P7	1-乙基-5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		1.08	436	4	186-188
P8	6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]咪唑并[4,5-b]吡啶-2-酮		0.83	455	4	252-254
P9	5-乙基磺醯基-1,3-二甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		0.73	454	4	262-264
P10	5-乙基氫硫基-1,3-二甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		0.93	422	4	
P11	5-乙基磺醯基-1,3-二甲基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]嗒咿-6-基]苯并咪唑-2-酮		0.76	455	4	279-281

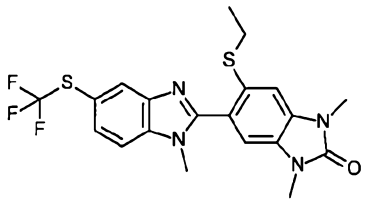
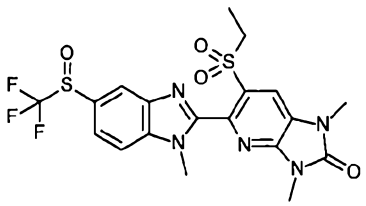
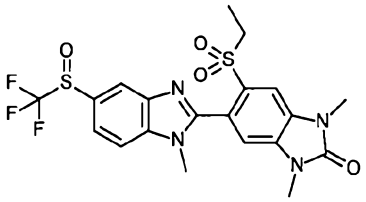
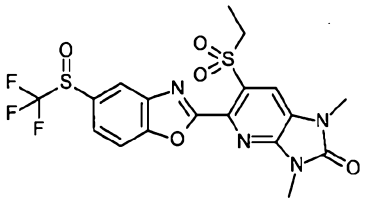
編號	IUPAC 名稱	結構	LCMS			Mp（°C）
			R_t（min）	$[M+H]^+$（測量的）	方法	
P12	5-乙基氫硫基-1,3-二甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		1.05	422	4	
P13	1-環丙基磺醯基-5-乙基磺醯基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		1.01	544	4	222-224
P14	5-乙基磺醯基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-2-側氧基-苯并咪唑-1-甲腈		0.97	465	4	258-260
P15	5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-2-側氧基-苯并咪唑-1-甲腈		1.06	433	4	255–257
P16	6-乙基磺醯基-1-甲基-3-(甲基磺醯基甲基)-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		0.84	532	4	284–286
P17	6-乙基磺醯基-1-甲基-3-(甲基氫硫基甲基)-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		0.95	500	4	214–216

編號	IUPAC 名稱	結構	LCMS			Mp（℃）
			R_t（min）	$[M+H]^+$（測量的）	方法	
P18	5-乙基磺醯基-1-(甲氧基-甲基)-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		0.91	484	4	166–168
P19	6-乙基磺醯基-1-甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-3-(2,2,2-三氟乙基)苯并咪唑-2-酮		1.03	522	4	238–240
P20	1-(環丙烷羰基)-5-乙基磺醯基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		1.09	508	4	258–260
P21	6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-5-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]嗒呯-6-基]咪唑并[4,5-b]吡啶-2-酮		0.84	456	4	255–257
P22	6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]咪唑并[4,5-b]吡啶-2-酮		0.90	455	4	
P23	5-乙基磺醯基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-2-側氧基-苯并咪唑-1-甲酸乙酯		0.99	512	4	242–244

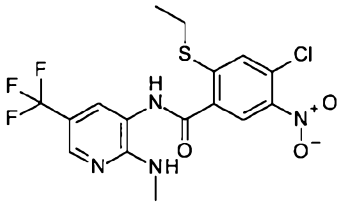
編號	IUPAC 名稱	結構	LCMS			Mp（°C）
			R_t（min）	$[M+H]^+$（測量的）	方法	
P24	6-乙基氫硫基-1,3-二甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]咪唑并[4,5-b]吡啶-2-酮		0.99	423	4	
P25	5-乙基磺醯基-1,3-二甲基-6-[5-(三氟甲基磺醯基)-1,3-苯并噁唑-2-基]苯并咪唑-2-酮		1.13	504	4	216-218
P26	6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-5-[5-(三氟甲基磺醯基)-1,3-苯并噁唑-2-基]咪唑并[4,5-b]吡啶-2-酮		1.03	505	4	247 -249
P27	5-乙基氫硫基-1,3-二甲基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]嗒吡-6-基]苯并咪唑-2-酮		0.93	423	4	
P28	5-乙基氫硫基-1,3-二甲基-6-[5-(三氟甲基氫硫基)-1,3-苯并噁唑-2-基]苯并咪唑-2-酮		1.43	440	4	206-208
P29	5-乙基磺醯基-1,3-二甲基-6-[5-(三氟甲基氫硫基)-1,3-苯并噁唑-2-基]苯并咪唑-2-酮		1.18	472	4	234-236

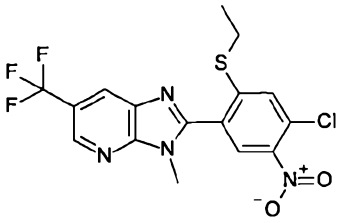
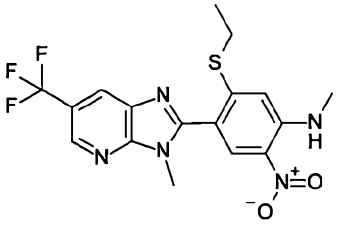
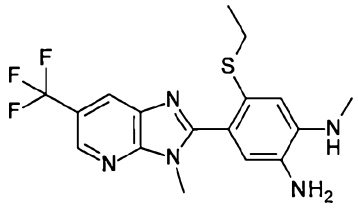
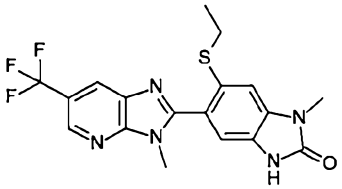
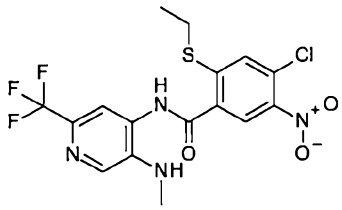
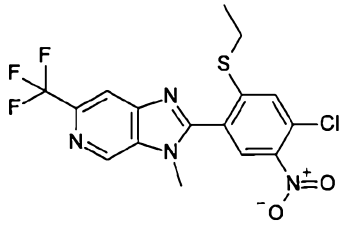
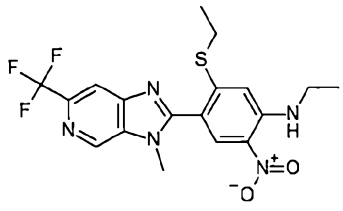
編號	IUPAC 名稱	結構	LCMS			Mp（℃）
			R_t（min）	$[M+H]^+$（測量的）	方法	
P30	1-環丙基磺醯基-5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		1.08	512	4	
P31	5-乙基氫硫基-1-(甲氧基-甲基)-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		1.04	452	4	
P32	6-乙基氫硫基-1-甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-3-(2,2,2-三氟乙基)苯并咪唑-2-酮		1.09	490	4	
P33	1-(環丙烷羰基)-5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		1.19	476	4	
P34	6-乙基氫硫基-1-甲基-3-(甲基氫硫基甲基)-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯并咪唑-2-酮		1.10	468	4	
P35	6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-5-[5-(三氟甲基氫硫基)-1,3-苯并噁唑-2-基]咪唑并[4,5-b]吡啶-2-酮		1.49	473	3	246 -248

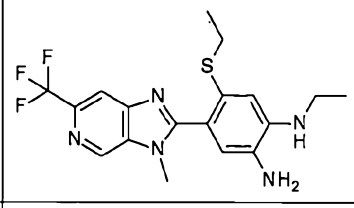
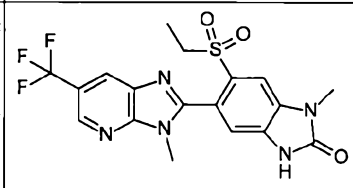
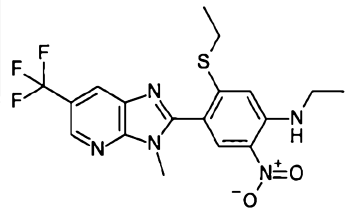
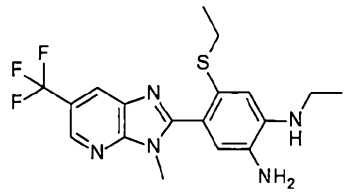
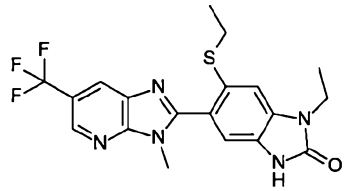
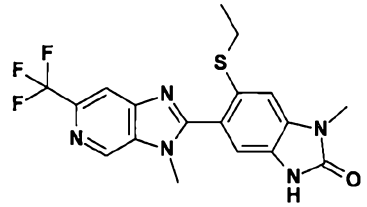
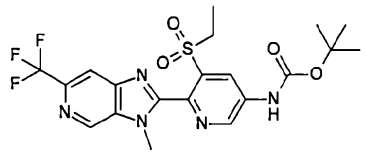
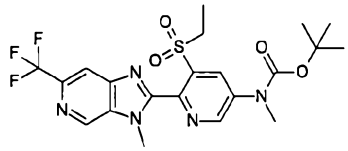
編號	IUPAC 名稱	結構	LCMS			Mp（°C）
			R_t（min）	$[M+H]^+$（測量的）	方法	
P36	5-乙基磺醯基-1,3-二甲基-6-[1-甲基-5-(三氟甲基-氫硫基)苯并咪唑-2-基]苯并咪唑-2-酮		1.02	485	4	189 -191
P37	5-乙基磺醯基-1,3-二甲基-6-[1-甲基-5-(三氟甲基-磺醯基)苯并咪唑-2-基]苯并咪唑-2-酮		0.99	517	4	142 -144
P38	6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-5-[1-甲基-5-(三氟甲基-氫硫基)苯并咪唑-2-基]咪唑并[4,5-b]吡啶-2-酮		1.07	486	4	
P39	6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-5-[1-甲基-5-(三氟甲基-磺醯基)苯并咪唑-2-基]咪唑并[4,5-b]吡啶-2-酮		1.02	518	4	
P40	5-乙基磺醯基-1,3-二甲基-6-[5-(三氟甲基)-1,3-苯并噁唑-2-基]苯并咪唑-2-酮		1.04	440	4	236 -238
P41	5-乙基氫硫基-1,3-二甲基-6-[5-(三氟甲基)-1,3-苯并噁唑-2-基]苯并咪唑-2-酮		1.58	408	3	205 - 207

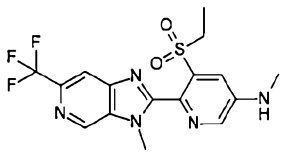
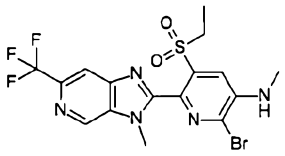
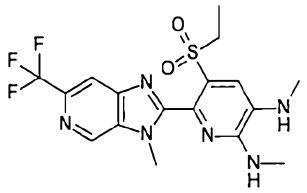
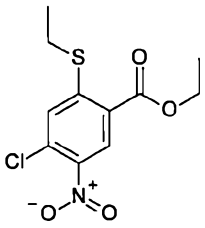
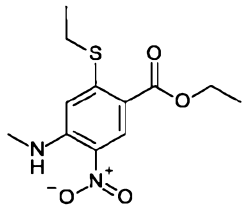
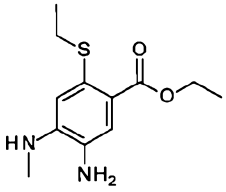
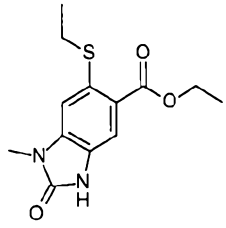
編號	IUPAC 名稱	結構	LCMS			Mp（°C）
			R_t（min）	$[M+H]^+$（測量的）	方法	
P42	5-乙基氫硫基-1,3-二甲基-6-[1-甲基-5-(三氟甲基-氫硫基)苯并咪唑-2-基]苯并咪唑-2-酮		1.10	453	4	
P43	6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-5-[1-甲基-5-(三氟甲基-亞磺醯基)苯并咪唑-2-基]咪唑并[4,5-b]吡啶-2-酮		0.91	502	4	
P44	5-乙基磺醯基-1,3-二甲基-6-[1-甲基-5-(三氟甲基-亞磺醯基)苯并咪唑-2-基]苯并咪唑-2-酮		0.90	501	4	144 - 146
P45	6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-5-[5-(三氟甲基亞磺醯基)-1,3-苯并噁唑-2-基]咪唑并[4,5-b]吡啶-2-酮		0.95	489	4	230 - 232

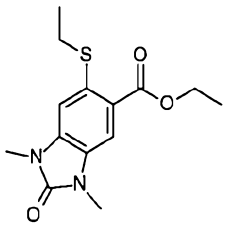
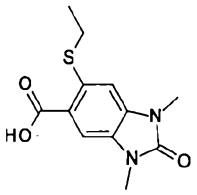
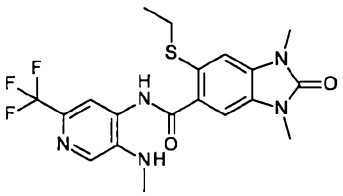
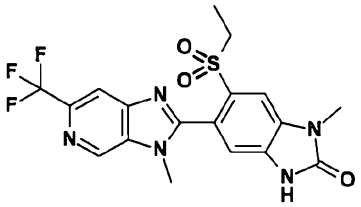
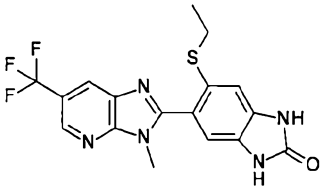
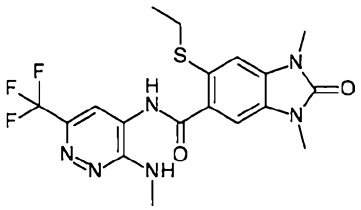
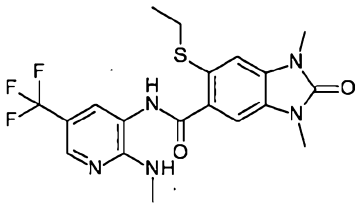
〔表I〕：具有式I-b、II-b、III、IV、V、VI、XI、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII和XXIII的化合物的實例

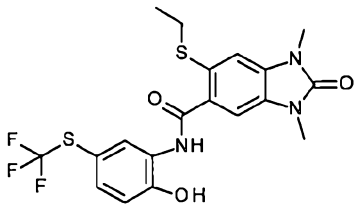
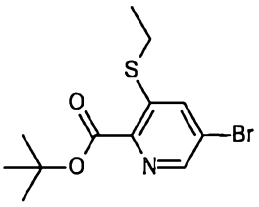
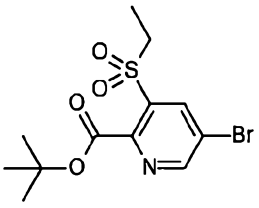
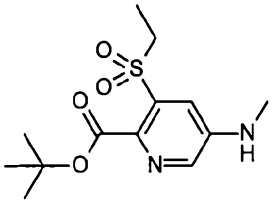
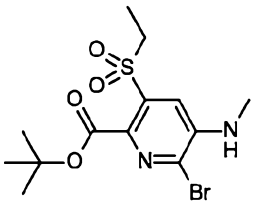
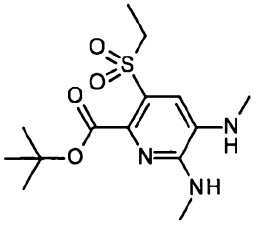
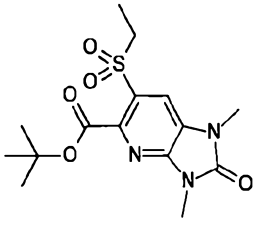
編號	IUPAC 名稱	結構	LCMS 或 ^{1}H NMR			Mp（°C）
			R_t（min）	$[M+H]^+$（測量的）	方法	
I1	4-氯-2-乙基氫硫基-N-[2-(甲基胺基)-5-(三氟甲基)-3-吡啶基]-5-硝基-苯甲醯胺		0.94	435/437	4	220-222

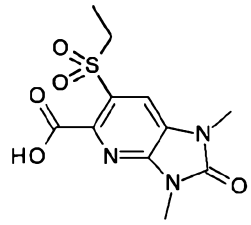
編號	IUPAC 名稱	結構	LCMS 或 ^{1}H NMR			Mp（℃）
			R_t（min）	$[M+H]^+$（測量的）	方法	
I2	2-(4-氯-2-乙基氫硫基-5-硝基-苯基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶		1.03	417/419	4	
I3	5-乙基氫硫基-N-甲基-4-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-2-硝基-苯胺		0.96	412	4	181-183
I4	4-乙基氫硫基-N2-甲基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯-1,2-二胺		0.85	382	4	164-166
I5	5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮		0.81	408	4	248-250
I6	4-氯-2-乙基氫硫基-N-[5-(甲基胺基)-2-(三氟甲基)-4-吡啶基]-5-硝基-苯甲醯胺		0.97	435/437	1	
I7	2-(4-氯-2-乙基氫硫基-5-硝基-苯基)-3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶		1.06	417/419	1	
I8	N-乙基-5-乙基氫硫基-4-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-2-硝基-苯胺		1.05	426	1	

編號	IUPAC 名稱	結構	LCMS 或 ^{1}H NMR			Mp（°C）
			R_t（min）	$[M+H]^+$（測量的）	方法	
I9	N2-乙基-4-乙基氫硫基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]苯-1,2-二胺		0.96	396	1	
I10	5-乙基磺醯基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮		0.71	440	4	>280
I11	N-乙基-5-乙基氫硫基-4-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-2-硝基-苯胺		1.22	426	4	
I12	N2-乙基-4-乙基氫硫基-5-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]苯-1,2-二胺		1.05	396	4	
I13	3-乙基-5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮		0.99	422	4	
I14	5-乙基氫硫基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮		0.87	408	4	272-274
I15	N-[5-乙基磺醯基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]胺基甲酸三級丁酯		1.08	486	4	
I16	N-[5-乙基磺醯基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-3-吡啶基]-N-甲基-胺基甲酸三級丁酯		1.03	500	4	

編號	IUPAC 名稱	結構	LCMS 或 ^{1}H NMR			Mp（°C）
			R_t（min）	$[M+H]^+$（測量的）	方法	
I17	5-乙基磺醯基-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺		1.48	400	3	
I18	2-溴-5-乙基磺醯基-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-3-胺		1.48	478/480	3	
I19	5-乙基磺醯基-N2,N3-二甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]吡啶-2,3-二胺		0.93	429	4	
I20	4-氯-2-乙基氫硫基-5-硝基-苯甲酸乙酯		1.62	290/292	3	
I21	2-乙基氫硫基-4-(甲基胺基)-5-硝基-苯甲酸乙酯		1.12	285	4	
I22	5-胺基-2-乙基氫硫基-4-(甲基胺基)苯甲酸乙酯		0.83	255	4	
I23	6-乙基氫硫基-1-甲基-2-側氧基-3H-苯并咪唑-5-甲酸乙酯		0.85	281	4	

編號	IUPAC 名稱	結構	LCMS 或 ^{1}H NMR			Mp（℃）
			R_t（min）	$[M+H]^+$（測量的）	方法	
I24	6-乙基氫硫基-1,3-二甲基-2-側氧基-苯并咪唑-5-甲酸乙酯		0.91	295	4	
I25	6-乙基氫硫基-1,3-二甲基-2-側氧基-苯并咪唑-5-甲酸		0.69	267	4	
I26	6-乙基氫硫基-1,3-二甲基-N-[5-(甲基胺基)-2-(三氟甲基)-4-吡啶基]-2-側氧基-苯并咪唑-5-甲醯胺		0.87	440	4	
I27	5-乙基磺醯基-3-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶-2-基]-1H-苯并咪唑-2-酮		0.82	440	4	320-322
I28	5-乙基氫硫基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]-1,3-二氫苯并咪唑-2-酮		0.89	394	4	
I29	6-乙基氫硫基-1,3-二甲基-N-[3-(甲基胺基)-6-(三氟甲基)嗒啡-4-基]-2-側氧基-苯并咪唑-5-甲醯胺		0.96	441	4	
I30	6-乙基氫硫基-1,3-二甲基-N-[2-(甲基胺基)-5-(三氟甲基)-3-吡啶基]-2-側氧基-苯并咪唑-5-甲醯胺		0.91	440	4	

編號	IUPAC 名稱	結構	LCMS 或 ^{1}H NMR			Mp（℃）
			R_t（min）	$[M+H]^+$（測量的）	方法	
I31	6-乙基氫硫基-N-[2-羥基-5-(三氟甲基氫硫基)苯基]-1,3-二甲基-2-側氧基-苯并咪唑-5-甲醯胺		1.24	$(M-H)^-$：456	4	
I32	5-溴-3-乙基氫硫基-吡啶-2-甲酸三級丁酯		^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 1.40 (t, 3H), 1.65 (s, 9H), 2.93 (q, 2H), 7.75 (d, 1H), 8.45 (d, 1H)。			
I33	5-溴-3-乙基磺醯基-吡啶-2-甲酸三級丁酯		^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 1.35 (t, 3H,) 1.65 (s, 9H), 3.53 (q, 2H), 8.45 (d, 1H), 8.87 (d, 1H)。			
I34	3-乙基磺醯基-5-(甲基胺基)吡啶-2-甲酸三級丁酯		^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 1.37 (t, 3H), 1.63 (s, 9H), 2.94 (s, 3H), 3.59 (q, 2H), 7.27 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 8.3 (br s, 1H)。			
I35	6-溴-3-乙基磺醯基-5-(甲基胺基)吡啶-2-甲酸三級丁酯		^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 1.35 (t, 3H), 1.63 (s, 9H), 3.00 (s, 3H), 3.57 (q, 2H), 5.0 (br s, 1H), 7.28 (s, 1H)。			
I36	3-乙基磺醯基-5,6-雙(甲基胺基)吡啶-2-甲酸三級丁酯		^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 1.32 (t, 3H), 1.63 (s, 9H), 2.86 (s, 3H), 3.04 (s, 3H), 3.40 (q, 2H), 4.76 (br s, 1H), 7.06 (s, 1H)。			
I37	6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-2-側氧基-咪唑并[4,5-b]吡啶-5-甲酸三級丁酯		^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 1.33 (t, 3H), 1.66 (s, 9H), 3.48 (q, 2H), 3.50 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 7.68 (s, 1H)。			

編號	IUPAC 名稱	結構	LCMS 或 ^{1}H NMR			Mp（°C）
			R_t（min）	$[M+H]^+$（測量的）	方法	
I38	6-乙基磺醯基-1,3-二甲基-2-側氧基-咪唑并[4,5-b]吡啶-5-甲酸		^{1}H NMR (400 MHz, d_6-DMSO) δ ppm 1.19 (t, 3H), 3.38 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.49 (q, 2H), 7.92 (s, 1H)。			

【0305】 藉由添加其他具有殺昆蟲、殺蟎和/或殺真菌活性的成分，根據本發明的組成物的活性可以顯著地加寬，並且適合於普遍情況。具有式I之化合物與其他具有殺昆蟲、殺蟎和/或殺真菌活性的成分的混合物還可以具有另外的意料之外的優點，該等優點還可以在更寬的意義上描述為協同活性。例如，植物對其更好的耐受性、降低的植物毒性、昆蟲可以在它們的不同發育階段得到控制、或者在它們的生產期間（例如，在研磨或者混合過程中，在它們的儲藏或它們的使用過程中）更好的行為。

【0306】 在這裡，合適的活性成分的添加物係例如以下類別的活性成分的代表物：有機磷化合物、硝基苯酚衍生物、硫脲、保幼激素、甲脒、二苯甲酮衍生物、脲類、吡咯衍生物、胺基甲酸酯、擬除蟲菊酯、氯化烴、醯基脲、吡啶基亞甲基胺基衍生物、大環內酯類、新煙鹼以及蘇芸金芽孢桿菌製劑。

【0307】 具有式I之化合物與活性成分的以下混合物係較佳的（縮寫“TX”意為“選自下組之化合物，該組由描述於本發明的表1至12和表P中的化合物組成”）：

【0308】 佐劑，該佐劑選自由以下物質組成之群組：石油（別名）（628）+ TX，

【0309】 殺蟎劑，該殺蟎劑選自由以下物質組成之群組：1,1-雙(4-氯苯基)-2-乙氧基乙醇（IUPAC名稱）（910）+ TX、2,4-二氯苯基苯磺酸酯（IUPAC/化學文摘名）（1059）+ TX、2-氟-N-甲基-N-1-萘乙醯胺（IUPAC名稱）（1295）

+ TX、4-氯苯基苯基碸（IUPAC名稱）（981）+ TX、阿巴汀（1）+ TX、滅蠕醌（ acequinocyl）（3）+ TX、乙醯蟲腈 （ acetoprole）[CCN] + TX、氟丙菊酯（ acrinathrin）（9）+ TX、涕滅威（aldicarb）（16）+ TX、涕滅碸威（aldoxycarb）（863）+ TX、α-氯氰菊酯（alpha-cypermethrin）（202）+ TX、賽硫磷（ amidithion）（870）+ TX、磺胺蠕酯 （amidoflumet）[CCN] + TX、胺基硫代鹽（ amidothioate）（872）+ TX、胺吸磷（ amiton）（875）+ TX、胺吸磷草酸氫鹽（amiton hydrogen oxalate）（875）+ TX、雙甲脒（amitraz ）（24）+ TX、殺蠕特（aramite）（881）+ TX、三氧化二砷（882）+ TX、AVI 382（化合物代碼）+ TX、AZ 60541（化合物代碼）+ TX、益棉磷（44）+ TX、保棉磷（azinphos-methyl）（45）+ TX、偶氮苯（IUPAC名稱）（888）+ TX、三唑錫（azacyclotin）（46）+ TX、偶氮磷（azothoate）（889）+ TX、苯菌靈（62）+ TX、苯諾沙磷（benoxafos）（別名）[CCN] + TX、苯蠕特（benzoximate）（71）+ TX、苯甲酸苄酯（IUPAC名稱）[CCN] + TX、聯苯肼酯（bifenazate）（74）+ TX、氟氯菊酯（ bifenthrin）（76）+ TX、樂殺螨（ binapacryl）（907）+ TX、溴滅菊酯（brofenvalerate）（別名）+ TX、溴烯殺（bromocyclene）（918）+ TX、溴硫磷（bromophos）（920）+ TX、乙基溴硫磷（921）+ TX、溴螨酯（bromopropylate）（94）+ TX、噻嗪酮（buprofezin）（99）+ TX、丁酮威（butocarboxim）（103）+ TX、丁酮碸威（butoxycarboxim）（104）+ TX、丁酮威（butylpyridaben）（別名）+ TX、石硫合劑（calcium polysulfide）（IUPAC名稱）（111）+ TX、毒殺芬（campheechlor）（941）+ TX、氯滅殺威（carbanolate）（943）+ TX、甲萘威（115）+ TX、克百威（carbofuran）（118）+ TX、卡波硫磷（ carbophenothion）（947）+ TX、CGA 50’ 439（發展代碼）（125）+ TX、滅蠕猛（chinomethionat）（126）+ TX、殺螨醚（chlorbenside）（959）+ TX、殺蟲脒（ chlordimeform）（964）+ TX、殺蟲脒鹽酸鹽（964）+ TX、溴蟲腈（ chlorfenapyr）（130）+ TX、敵螨

（ chlorfenethol）（968）+ TX、殺螨酯（chlorfenson）（970）+ TX、敵螨特（chlorfensulfide）（971）+ TX、氯芬磷（131）+ TX、乙酯殺螨醇（chlorobenzilate）（975）+ TX、伊托明（chloromebuform）（977）+ TX、滅蟲脲（chloromethiuron）（978）+ TX、丙酯殺螨醇（chloropropylate）（983）+ TX、毒死蜱（ chlorpyrifos ）（145）+ TX、甲基毒死蜱（146）+ TX、蟲螨磷（chlorthiophos）（994）+ TX、瓜菊酯（cinerin）I（696）+ TX、瓜菊酯II（696）+ TX、瓜葉菊素（cinerins）（696）+ TX、四螨嗪（clofentezine）（158）+ TX、氯氰碘柳胺[CCN]（別名）+ TX、庫馬磷（174）+ TX、克羅米通（別名）[CCN] + TX、巴毒磷（crotoxyphos）（1010）+ TX、硫雜靈（1013）+ TX、果蟲磷（cyanthoate）（1020）+ TX、丁氟螨酯 （CAS登記號：400882-07-7）+ TX、三氯氟氰菊酯（196）+ TX、三環錫（199）+ TX、氯氰菊酯（201）+ TX、DCPM（1032）+ TX、DDT（219）+ TX、田樂磷（demephion）（1037）+ TX、田樂磷（demephion）-O（1037）+ TX、田樂磷-S（1037）+ TX、內吸磷（demeton）（1038）+ TX、甲基內吸磷（224）+ TX、內吸磷-O（1038）+ TX、甲基內吸磷-O（224）+ TX、內吸磷-S（1038）+ TX、甲基內吸磷-S（224）+ TX、內吸磷-S-甲基磺隆（demeton-S-methylsulfon）（1039）+ TX、殺螨隆（ diafen-thiuron）（226）+ TX、氯亞胺硫磷（dialifos）（1042）+ TX、二嗪磷（ diazinon）（227）+ TX、苯氟磺胺（230）+ TX、敵敵畏（236）+ TX、甲氟磷（dicliphos）（別名）+ TX、開樂散（242）+ TX、百治磷（243）+ TX、遍地克（1071）+ TX、甲氟磷（dimefox）（1081）+ TX、樂果（dimethoate）（262）+ TX、二甲殺螨黴素（dinacti）（別名）（653）+ TX、消螨酚（dinex）（1089）+ TX、消螨酚（dinex-diclexine）（1089）+ TX、消螨通（dinobuton）（269）+ TX、敵螨普（dinocap）（270）+ TX、敵螨普-4 [CCN] + TX、敵螨普-6 [CCN] + TX、二硝酯（1090）+ TX、硝戊酯（dinopenton）（1092）+ TX、硝辛酯（dinosulfon）（1097）+ TX、硝丁酯（dinoterbon）（1098）+ TX、

敵惡磷（1102）+ TX、二苯碸（IUPAC名稱）（1103）+ TX、雙硫侖[CCN] + TX、乙拌磷（278）+ TX、DNOC （282）+ TX、苯氧炔螨（dofenapyn）（1113）+ TX、朵拉克汀（別名）[CCN] + TX、硫丹（294）+ TX、因毒磷（endothion）（1121）+ TX、EPN（297）+ TX、依立諾克丁（別名）[CCN] + TX、乙硫磷（309）+ TX、益硫磷（ethoate-methyl）（1134）+ TX、乙螨唑（etoxazole）（320）+ TX、乙嘧硫磷（etrimfos）（1142）+ TX、抗螨唑（fenazaflor）（1147）+ TX、喹螨醚（328）+ TX、苯丁錫（fenbutatin oxide）（330）+ TX、苯硫威（fenothiocarb）（337）+ TX、甲氰菊酯（342）+ TX、吡螨胺（fenpyrad）（別名）+ TX、唑螨酯（fenpyroximate）（345）+ TX、芬螨酯（fenson）（1157）+ TX、氟硝二苯胺（fentrifanil）（1161）+ TX、氰戊菊酯（349）+ TX、氟蟲腈（354）+ TX、嘧螨酯（fluacrypyrim）（360）+ TX、氟佐隆（1166）+ TX、氟螨噻（flubenzimine）（1167）+ TX、氟螨脲（366）+ TX、氟氰戊菊酯（flucythrinate）（367）+ TX、聯氟螨（fluenetil）（1169）+ TX、氟蟲脲（370）+ TX、氟氯苯菊酯（flumethrin）（372）+ TX、氟殺螨（fluorbenside）（1174）+ TX、氟胺氰菊酯（fluvalinate）（1184）+ TX、FMC 1137（發展代碼）（1185）+ TX、抗螨胺（405）+ TX、抗螨胺鹽酸鹽（405）+ TX、安硫磷（formothion）（1192）+ TX、胺甲威（formparanate）（1193）+ TX、γ-HCH（430）+ TX、果綠啶（glyodin）（1205）+ TX、苄螨醚（halfenprox）（424）+ TX、庚烯醚（heptenophos）（432）+ TX、十六碳烷基環丙烷羧酸酯（IUPAC/化學文摘名）（1216）+ TX、噻螨酮（441）+ TX、碘甲烷（IUPAC名稱）（542）+ TX、水胺硫磷（isocarbophos）（別名）（473）+ TX、異丙基0-(甲氧基胺基硫代磷醯基)水楊酸酯（IUPAC名稱）（473）+ TX、艾弗麥克素 （別名）[CCN] + TX、茉莉菊酯（jasmolin）I（696）+ TX、茉莉菊酯II（696）+ TX、碘硫磷（jodfenphos）（1248）+ TX、靈丹（430）+ TX、虱螨脲（ lufenuron）（490）+ TX、馬拉松 （492）+ TX、苄丙二腈（malonoben）

（1254）+ TX、滅加松（mecarbam）（502）+ TX、地胺磷（mephosfolan）（1261）+ TX、甲硫芬（mesulfen）（別名）[CCN] + TX、蟲螨畏（methacrifos）（1266）+ TX、甲胺磷（527）+ TX、殺撲磷（methidathion）（529）+ TX、滅賜克（530）+ TX、滅多蟲（ methomyl）（531）+ TX、溴甲烷（537）+ TX、速滅威（metolcarb）（550）+ TX、美文松 （556）+ TX、自克威（mexacarbate）（1290）+ TX、米爾螨素（milbemectin）（557）+ TX、殺螨菌素肟（milbemycin oxime）（別名）[CCN] + TX、丙胺氟磷（mipafox）（1293）+ TX、久效磷（ monocrotophos）（561）+ TX、茂硫磷（morphothion）（1300）+ TX、莫昔克丁（ moxidectin）（別名）[CCN] + TX、二溴磷（naled）（567）+ TX、NC-184（化合物代碼）+ TX、NC-152（化合物代碼）+ TX、氟蚊靈（nifluridide）（1309）+ TX、尼柯黴素（別名）[CCN] + TX、戊氰威（nitrilacarb）（1313）+ TX、戊氰威（nitrilacarb）1 : 1氯化鋅錯合物（1313）+ TX、NNI-0101（化合物代碼）+ TX、NNI-0250（化合物代碼）+ TX、氧樂果（omethoate）（594）+ TX、殺線威（ oxamyl）（602）+ TX、亞異碸磷（oxydeprofos）（1324）+ TX、碸拌磷（oxydisulfoton）（1325）+ TX、pp'-DDT（219）+ TX、對硫磷（615）+ TX、氯菊酯（626）+ TX、石油（別名）（628）+ TX、芬硫磷（1330）+ TX、稻豐散（631）+ TX、甲拌磷（636）+ TX、伏殺硫磷（637）+ TX、硫環磷（phosfolan）（1338）+ TX、亞胺硫磷（638）+ TX、磷胺（639）+ TX、辛硫磷（642）+ TX、甲基嘧啶磷（652）+ TX、氯化松節油（polychloroterpenes）（傳統名稱）（1347）+ TX、殺螨黴素（polynactins）（別名）（653）+ TX、丙氯諾（1350）+ TX、丙溴磷（662）+ TX、蜱虱威（promacyl）（1354）+ TX、克螨特（671）+ TX、胺丙畏（propetamphos）（673）+ TX、殘殺威（678）+ TX、乙噻唑磷（prothidathion）（1360）+ TX、發硫磷（prothoate）（1362）+ TX、除蟲菊酯I（696）+ TX、除蟲菊酯II（696）+ TX、除蟲菊素（pyrethrins）（696）+ TX、噠螨靈（699）+ TX、嗒唅硫磷（pyridaphenthion）

（701）+ TX、嘧螨醚（pyrimidifen）（706）+ TX、嘧硫磷（1370）+ TX、喹硫磷（quinalphos）（711）+ TX、喹硫磷（quintiofos）（1381）+ TX、R-1492（發展代碼）（1382）+ TX、RA-17（發展代碼）（1383）+ TX、魚藤酮（722）+ TX、八甲磷（schradan）（1389）+ TX、硫線磷（sebufos）（別名）+ TX、塞拉菌素（selamectin）（別名）[CCN] + TX、SI-0009（化合物代碼）+ TX、蘇硫磷（sophamide）（1402）+ TX、季酮螨酯（738）+ TX、螺甲螨酯（739）+ TX、SSI-121（發展代碼）（1404）+ TX、舒非侖（別名）[CCN] + TX、氟蟲胺（sulfluramid）（750）+ TX、治螟磷（sulfotep）（753）+ TX、硫黃（754）+ TX、SZI-121（發展代碼）（757）+ TX、氟胺氰菊酯（398）+ TX、吡螨胺（763）+ TX、TEPP（1417）+ TX、三級丁威（terbam）（別名）+ TX、司替羅磷（777）+ TX、三氯殺螨碸（tetradifon）（786）+ TX、殺螨黴素（tetranactin）（別名）（653）+ TX、殺螨硫醚（tetrasul）（1425）+ TX、久效威（thiafenox）（別名）+ TX、抗蟲威（thiocarboxime）（1431）+ TX、久效威（thiofanox）（800）+ TX、甲基乙拌磷（thiometon）（801）+ TX、克殺螨（1436）+ TX、蘇力菌素（thuringiensin）（別名）[CCN] + TX、威菌磷（triamiphos）（1441）+ TX、苯噻螨（triarathene）（1443）+ TX、三唑磷（820）+ TX、唑呀威（triazuron）（別名）+ TX、敵百蟲（824）+ TX、氯苯乙丙磷（trifenofos）（1455）+ TX、甲殺螨黴素（trinactin）（別名）（653）+ TX、滅蚜硫磷（847）+ TX、氟吡唑蟲（vaniliprole）[CCN]和YI-5302（化合物代碼）+ TX，

【0310】 殺藻劑，該殺藻劑選自由以下物質組成之群組：百殺辛（bethoxazin）[CCN] + TX、二辛酸銅（IUPAC名稱）（170）+ TX、硫酸銅（172）+ TX、cybutryne [CCN] + TX、二氫萘醌（dichlone）（1052）+ TX、雙氯酚（232）+ TX、菌多酸（295）+ TX、三苯錫（fentin）（347）+ TX、熟石灰[CCN] + TX、代森鈉（nabam）（566）+ TX、滅藻醌（quinoclamine）（714）+ TX、醌萍

胺（quinonamid）（1379）＋TX、西瑪津（730）＋TX、三苯錫乙酸鹽（IUPAC名稱）（347）和氫氧化三苯錫（IUPAC名稱）（347）＋TX，

【0311】 驅蠕蟲劑，該驅蠕蟲劑選自由以下物質組成之群組：阿巴美丁（1）＋TX、克蘆磷酯（1011）＋TX、朵拉克汀（別名）[CCN]＋TX、依馬克丁（291）＋TX、依馬克丁苯甲酸酯（291）＋TX、依立諾克丁（別名）[CCN]＋TX、艾弗麥克素（別名）[CCN]＋TX、米爾倍黴素（別名）[CCN]＋TX、莫昔克丁（別名）[CCN]＋TX、哌啉[CCN]＋TX、塞拉菌素（selamectin）（別名）[CCN]＋TX、多殺菌素（737）和硫菌靈（thiophanate）（1435）＋TX，

【0312】 殺鳥劑，該殺鳥劑選自由以下物質組成之群組：氯醛糖（127）＋TX、異狄氏劑（1122）＋TX、倍硫磷（346）＋TX、吡啶-4-胺（IUPAC名稱）（23）和士的寧（745）＋TX，

【0313】 殺細菌劑，該殺細菌劑選自由以下物質組成之群組：1-羥基-1H-吡啶-2-硫酮（IUPAC名稱）（1222）＋TX、4-(喹喔啉-2-基胺基)苯磺醯胺（IUPAC名稱）（748）＋TX、8-羥基喹啉硫酸鹽（446）＋TX、溴硝醇（97）＋TX、二辛酸銅（IUPAC名稱）（170）＋TX、氫氧化銅（IUPAC名稱）（169）＋TX、甲酚[CCN]＋TX、雙氯酚（232）＋TX、雙吡硫翁（1105）＋TX、多地辛（1112）＋TX、敵磺鈉（fenaminosulf）（1144）＋TX、甲醛（404）＋TX、汞加芬（別名）[CCN]＋TX、春雷黴素（483）＋TX、春雷黴素鹽酸鹽水合物（483）＋TX、二(二甲基二硫代胺基甲酸鹽)鎳（IUPAC名稱）（1308）＋TX、三氯甲基吡啶（nitrapyrin）（580）＋TX、辛噻酮（octhilinone）（590）＋TX、奧索利酸（606）＋TX、土黴素（611）＋TX、羥基喹啉硫酸鉀（446）＋TX、烯丙苯噻唑（probenazole）（658）＋TX、鏈黴素（744）＋TX、鏈黴素倍半硫酸鹽（744）＋TX、葉枯酞（766）＋TX、和硫柳汞（別名）[CCN]＋TX，

【0314】 生物試劑，該生物試劑選自由以下物質構成的組：棉褐帶卷蛾顆

粒體病毒（Adoxophyes orana GV）（別名）（12）+ TX、放射形土壤桿菌（別名）（13）+ TX、捕食蟎（Amblyseius spp.）（別名）（19）+ TX、芹菜夜蛾核多角體病毒（Anagrapha falcifera NPV）（別名）（28）+ TX、Anagrus atomus（別名）（29）+ TX、蚜蟲寄生蜂（Aphelinus abdominalis）（別名）（33）+ TX、棉蚜寄生蜂（Aphidius colemani）（別名）（34）+ TX、食蚜癭蚊（Autographa californica NPV）（別名）（35）+ TX、苜蓿銀紋夜蛾核多角體病毒（Bacillus firmus）（別名）（38）+ TX、堅強芽孢桿菌（Bacillus firmus）（別名）（48）+ TX、球形芽孢桿菌（Bacillus sphaericus Neide）（學名）（49）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌（Bacillus thuringiensis Berliner）（學名）（51）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌.I（Bacillus thuringiensis subsp. aizawai）（學名）（51）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌以色列亞種（Bacillus thuringiensis subsp. israelensis）（學名）（51）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌日本亞種（Bacillus thuringiensis subsp. japonensis）（學名）（51）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克亞種（Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki）（學名）（51）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌擬步行甲亞種（Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis）（學名）（51）+ TX、球孢白僵菌（Beauveria bassiana）（別名）（53）+ TX、布氏白僵菌（Beauveria brongniartii）（別名）（54）+ TX、草蜻蛉（Chrysoperla carnea）（別名）（151）+ TX、孟氏隱唇瓢蟲（Cryptolaemus montrouzieri）（別名）（178）+ TX、蘋果蠹蛾顆粒體病毒（Cydia pomonella GV）（別名）（191）+ TX、西伯利亞離顎繭蜂（Dacnusa sibirica）（別名）（212）+ TX、豌豆潛葉蠅姬小蜂（Diglyphus isaea）（別名）（254）+ TX、麗蚜小蜂（Encarsia formosa）（學名）（293）+ TX、槳角蚜小蜂（Eretmocerus eremicus）（別名）（300）+ TX、玉米穗夜蛾核多角體病毒（Helicoverpa zea NPV）（別名）（431）+ TX、嗜菌異小桿線蟲（Heterorhabditis bacteriophora）和H · megidis（別名）（433）+ TX、會聚長足瓢蟲（Hippodamia convergens）（別名）（442）

+ TX、橘粉介殼蟲寄生蜂（Leptomastix dactylopii）（別名）（488）+ TX、盲蝽（Macrolophus caliginosus）（別名）（491）+ TX、甘藍夜蛾核多角體病毒（Mamestra brassicae NPV）（別名）（494）+ TX、Metaphycus helvolus（別名）（522）+ TX、黃綠綠僵菌（Metarhizium anisopliae var. acridum）（學名）（523）+ TX、金龜子綠僵菌小孢變種（Metarhizium anisopliae var. anisopliae）（學名）（523）+ TX、松黃葉蜂（Neodiprion sertifer）核多角體病毒和紅頭松樹葉蜂（N. lecontei）核多角體病毒（別名）（575）+ TX、小花蝽（別名）（596）+ TX、玫煙色擬青黴（Paecilomyces fumosoroseus）（別名）（613）+ TX、智利捕植蟎（Phytoseiulus persimilis）（別名）（644）+ TX、甜菜夜蛾（Spodoptera exigua multicapsid）多核衣殼核多角體病毒（學名）（741）+ TX、毛蚊線蟲（Steinernema bibionis）（別名）（742）+ TX、小卷蛾斯氏線蟲（Steinernema carpocapsae）（別名）（742）+ TX、夜蛾斯氏線蟲（別名）（742）+ TX、Steinernema glaseri（別名）（742）+ TX、Steinernema riobrave（另名）（742）+ TX、Steinernema riobravis（別名）（742）+ TX、Steinernema scapterisci（別名）（742）+ TX、斯氏線蟲屬（Steinernema spp.）（別名）（742）+ TX、赤眼蜂屬（別名）（826）+ TX、西方盲走蟎（Typhlodromus occidentalis）（別名）（844）和蠟蚧輪枝菌（Verticillium lecanii）（別名）（848）+ TX，

【0315】 土壤消毒劑，該土壤消毒劑選自由以下物質組成之群組：碘甲烷（IUPAC名稱）（542）和甲基溴（537） + TX，

【0316】 化學不育劑，該化學不育劑選自由以下物質組成之群組：唑磷嗪（apholate）[CCN] + TX、雙(氮丙啶)甲胺基膦硫化物（bisazir）（別名）[CCN] + TX、白消安（別名）[CCN] + TX、除蟲脲（250）+ TX、迪麥替夫（dimatif）（別名）[CCN] + TX、六甲蜜胺（hemel）[CCN] + TX、六甲磷（hempa）[CCN] + TX、甲基涕巴（metepa）[CCN] + TX、甲硫涕巴（methiotepa）[CCN] + TX、

不育特（methyl apholate）[CCN]＋TX、不孕啶（morzid）[CCN]＋TX、氟幼脲（penfluron）（別名）[CCN] ＋ TX、涕巴（tepa）[CCN] ＋ TX、硫代六甲磷（thiohempa）（別名）[CCN]＋TX、硫涕巴（別名）[CCN]＋TX、曲他胺（別名）[CCN]和尿烷亞胺（別名）[CCN]＋TX，

【0317】 昆蟲信息素，該昆蟲信息素選自由以下物質組成之群組：(E)-癸-5-烯-1-基乙酸酯與(E)-癸-5-烯-1-醇（IUPAC名稱）（222）＋TX、(E)-十三碳-4-烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（829）＋TX、(E)-6-甲基庚-2-烯-4-醇（IUPAC名稱）（541）＋TX、(E,Z)-十四碳-4,10-二烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（779）＋TX、(Z)-十二碳-7-烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（285）＋ TX、(Z)-十六碳-11-烯醛（IUPAC名稱）（436）＋TX、(Z)-十六碳-11-烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（437）＋TX、(Z)-十六碳-13-烯-11-炔-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（438）＋TX、(Z)-二十-13-烯-10-酮（IUPAC名稱）（448）＋TX、(Z)-十四碳-7-烯-1-醛（IUPAC名稱）（782）＋ TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-醇（IUPAC名稱）（783）＋ TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（784）＋ TX、(7E,9Z)-十二碳-7,9-二烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（283）＋ TX、(9Z,11E)-十四碳-9,11-二烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（780）＋TX、(9Z,12E)-十四碳-9,12-二烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（781）＋TX、14-甲基十八-1-烯（IUPAC名稱）（545）＋TX、4-甲基壬醛-5-醇與4-甲基壬醛-5-酮（IUPAC名稱）（544）＋TX、α-多紋素（multistriatin）（別名）[CCN]＋TX、西部松小蠹集合信息素（brevicomin）（別名）[CCN]＋TX、十二碳二烯醇（codlelure）（別名）[CCN] ＋ TX、十二碳二烯醇（codlemone）（別名）（167）＋ TX、誘蠅酮（cuelure）（別名）（179）＋ TX、環氧十九烷（disparlure）（277）＋TX、十二碳-8-烯-1基乙酸酯（IUPAC名稱）（286）＋TX、十二碳-9-烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（287）＋TX、十二碳-8＋TX、10-二烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（284）＋TX、多明尼加（dominicalure）（別名）[CCN]

+TX、4-甲基辛酸乙酯（IUPAC名稱）（317）+TX、丁香酚（別名）[CCN]+TX、南部松小蠹集合信息素（frontalin）（別名）[CCN]+TX、誘蟲十六酯（gossyplure）（別名）（420）+TX、誘殺烯混劑（grandlure）（421）+TX、誘殺烯混劑I（別名）（421）+TX、誘殺烯混劑II（別名）（421）+TX、誘殺烯混劑III（別名）（421）+TX、誘殺烯混劑IV（別名）（421）+TX、醋酸十六烯酯（hexalure）[CCN]+TX、齒小蠹二烯醇（ipsdienol）（別名）[CCN]+TX、小蠹烯醇（ipsenol）（別名）[CCN]+TX、金龜子性誘劑（japonilure）（別名）（481）+TX、裡尼汀（lineatin）（別名）[CCN]+TX、利特樂（litlure）（別名）[CCN]+TX、粉紋夜蛾性誘劑（looplure）（別名）[CCN]+TX、誘殺酯（medlure）[CCN]+TX、蒙托麼克酸（megatomoic acid）（別名）[CCN]+TX、誘蟲醚（methyl eugenol）（別名）（540）+TX、誘蟲烯（muscalure）（563）+TX、十八-2,13-二烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（588）+TX、十八-3,13-二烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（589）+TX、賀康彼（orfralure）（別名）[CCN]+TX、oryctalure（別名）（317）+TX、非樂康（ostramone）（別名）[CCN]+TX、誘蟲環（siglure）[CCN]+TX、索地丁（sordidin）（別名）（736）+TX、食菌甲誘醇（sulcatol）（別名）[CCN]+TX、十四-11-烯-1-基乙酸酯（IUPAC名稱）（785）+TX、特誘酮（839）+TX、特誘酮A（別名）（839）+TX、特誘酮B1（別名）（839）+TX、特誘酮B2（別名）（839）+TX、特誘酮C（別名）（839）和創科爾（trunc-call）（別名）[CCN]+TX，

【0318】 昆蟲驅避劑，該昆蟲驅避劑選自以下物質組成之群組：2-(辛基硫代)-乙醇（IUPAC名稱）（591）+TX、避蚊酮（butopyronoxyl）（933）+TX、丁氧基(聚丙二醇)（936）+TX、己二酸二丁酯（IUPAC名稱）（1046）+TX、鄰苯二甲酸二丁酯（1047）+TX、丁二酸二丁酯（IUPAC名稱）（1048）+TX、避蚊胺[CCN]+TX、驅蚊酯（dimethyl carbate）[CCN]+TX、鄰苯二甲酸二甲酯

[CCN]+TX、乙基已二醇(1137)+ TX、已脲[CCN] + TX、甲喹丁(methoquin-butyl)(1276)+ TX、甲基新癸醯胺 [CCN] + TX、草醯胺酸酯(oxamate)[CCN]和羥哌酯[CCN] + TX，

【0319】 殺昆蟲劑，該殺昆蟲劑選自以下物質組成之群組：1-二氯-1-硝基乙烷(IUPAC/化學文摘名稱)(1058)+ TX、1,1-二氯-2,2-二(4-乙基苯基)乙烷(IUPAC名稱)(1056)+ TX、1,2-二氯丙烷(IUPAC/化學文摘名稱)(1062)+ TX、帶有1,3-二氯丙烯的1,2-二氯丙烷(IUPAC名稱)(1063)+ TX、1-溴-2-氯乙烷(IUPAC/化學文摘名稱)(916)+ TX、乙酸2,2,2-三氯-1-(3,4-二氯苯基)乙基酯(IUPAC名稱)(1451)+ TX、2,2-二氯乙烯基 2-乙基亞磺醯基乙基 甲基 磷酸酯(IUPAC名稱)(1066)+ TX、二甲基胺基甲酸2-(1,3-二硫雜環戊烷-2-基)苯基酯(IUPAC/化學文摘名稱)(1109)+ TX、硫氰酸2-(2-丁氧基乙氧基)乙基酯(IUPAC/化學文摘名稱)(935)+ TX、甲基胺基甲酸2-(4,5-二甲基-1,3-二氧環戊烷-2-基)苯基酯(IUPAC/化學文摘名稱)(1084)+ TX、2-(4-氯-3,5-二甲苯基氧基)乙醇(IUPAC名稱)(986)+ TX、2-氯乙烯基 二乙基 磷酸酯(IUPAC名稱)(984)+ TX、2-咪唑啉酮(IUPAC名稱)(1225)+ TX、2-異戊醯基二氫茚-1,3-二酮(IUPAC名稱)(1246)+ TX、甲基胺基甲酸2-甲基(丙-2-炔基)胺基苯基酯(IUPAC名稱)(1284)+ TX、月桂酸2-硫氰基乙基酯(IUPAC名稱)(1433)+ TX、3-溴-1-氯丙-1-烯(IUPAC名稱)(917)+ TX、二甲基胺基甲酸3-甲基-1-苯基吡唑-5-基酯(IUPAC名稱)(1283)+ TX、甲基胺基甲酸4-甲基(丙-2-炔基)胺基-3,5-二甲苯基酯(IUPAC名稱)(1285)+ TX、二甲基胺基甲酸5,5-二甲基-3-側氧基環己-1-烯基酯(IUPAC名稱)(1085)+ TX、阿巴汀(1)+ TX、乙醯甲胺磷(2)+ TX、啶蟲脒(4)+ TX、家蠅磷(別名)[CCN] + TX、乙醯蟲腈[CCN] + TX、氟丙菊酯(9)+ TX、丙烯腈(IUPAC名稱)(861)+ TX、棉鈴威(15)+ TX、涕滅威(16)+ TX、涕滅碸威(863)+ TX、氯甲

橋萘（864）+ TX、烯丙菊酯（17）+ TX、阿洛胺菌素（別名）[CCN] + TX、除害威（866）+ TX、α-氯氰菊酯（202）+ TX、α-蛻皮激素（別名）[CCN] + TX、磷化鋁（640）+ TX、賽硫磷（870）+ TX、硫代醯胺（872）+ TX、滅害威（873）+ TX、胺吸磷（875）+ TX、胺吸磷草酸氫鹽（875）+ TX、雙甲脒（24）+ TX、新煙鹼（877）+ TX、乙基殺撲磷（883）+ TX、AVI 382（化合物代碼）+ TX、AZ 60541（化合物代碼）+ TX、印楝素（別名）（41）+ TX、甲基吡啶磷（42）+ TX、穀硫磷-乙基（44）+ TX、穀硫磷-甲基（45）+ TX、偶氮磷（889）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌δ內毒素類（別名）（52）+ TX、六氟矽酸鋇（別名）[CCN] + TX、多硫化鋇（IUPAC/化學文摘名稱）（892）+ TX、熏菊酯[CCN] + TX、Bayer 22/190（發展代碼）（893）+ TX、Bayer 22408（發展代碼）（894）+ TX、噁蟲威（bendiocarb）（58）+ TX、丙硫克百威（60）+ TX、殺蟲磺（66）+ TX、β氟氯氰菊酯（194）+ TX、β-氯氰菊酯（203）+ TX、聯苯菊酯（76）+ TX、生物烯丙菊酯（78）+ TX、生物烯丙菊酯S-環戊烯基異構物（別名）（79）+ TX、戊環苄呋菊酯（bioethanomethrin）[CCN] + TX、生物氯菊酯（908）+ TX、除蟲菊酯（80）+ TX、二(2-氯乙基)醚（IUPAC名稱）（909）+ TX、雙三氟蟲脲（83）+ TX、硼砂（86）+ TX、溴滅菊酯+ （別名）TX、溴苯烯磷（914）+ TX、溴殺烯（918）+ TX、溴-DDT（別名）[CCN] + TX、溴硫磷（920）+ TX、溴硫磷-乙基（921）+ TX、合殺威（924）+ TX、噻吩酮（99）+ TX、畜蟲威（926）+ TX、脫甲基丁嘧啶磷（butathiofos）（927）+ TX、丁酮威（103）+ TX、丁酯膦（932）+ TX、丁酮碸威（104）+ TX、丁基噠螨靈（別名）+ TX、硫線磷（109）+ TX、砷酸鈣[CCN] + TX、氰化鈣（444）+ TX、多硫化鈣（IUPAC名稱）（111）+ TX、毒殺芬（941）+ TX、氯滅殺威（943）+ TX、甲萘威（115）+ TX、克百威（118）+ TX、二硫化碳（IUPAC/化學文摘名稱）（945）+ TX、四氯化碳（IUPAC名稱）（946）+ TX、三硫磷（947）+ TX、丁硫克百成（119）+ TX、殺螟丹（123）+

TX、殺螟丹鹽酸鹽（123）+TX、西伐丁（別名）（725）+TX、冰片丹（960）+TX、氯丹（128）+TX、開蓬（963）+TX、殺蟲脒（964）+TX、殺蟲脒鹽酸鹽（964）+TX、氯氧磷（129）+TX、溴蟲腈（130）+TX、毒蟲畏（131）+TX、定蟲隆（132）+TX、氯甲磷（136）+TX、氯仿[CCN]+TX、三氯硝基甲烷（141）+TX、氯辛硫磷（989）+TX、滅蟲吡啶（990）+TX、毒死蜱（145）+TX、毒死蜱-甲基（146）+TX、蟲螨磷（994）+TX、環蟲醯肼（150）+TX、灰菊素I（696）+TX、灰菊素II（696）+TX、灰菊素類（696）+TX、順式苄呋菊酯（cis-resmethrin）（別名）+TX、順式苄呋菊酯（cismethrin）（80）+TX、功夫菊酯（別名）+TX、除線威（999）+TX、氯氰碘柳胺（別名）[CCN]+TX、噻蟲胺（165）+TX、乙醯亞砷酸銅[CCN]+TX、砷酸銅[CCN]+TX、油酸銅[CCN]+TX、蠅毒磷（174）+TX、畜蟲磷（1006）+TX、克羅米通（別名）[CCN]+TX、巴毒磷（1010）+TX、克蘆磷酯（1011）+TX、冰晶石（別名）（177）+TX、CS 708（發展代碼）（1012）+TX、苯腈膦（1019）+TX、殺螟腈（184）+TX、果蟲磷（1020）+TX、環蟲菊酯[CCN]+TX、乙氰菊酯（188）+TX、氟氯氰菊酯（193）+TX、三氟氯氰菊酯（196）+TX、氯氰菊酯（201）+TX、苯氰菊酯（206）+TX、環丙馬秦（209）+TX、畜蜱磷（別名）[CCN]+TX、d-檸檬烯（別名）[CCN]+TX、d-四甲菊酯（別名）（788）+TX、DAEP（1031）+TX、棉隆（216）+TX、DDT（219）+TX、單甲基克百威(decarbofuran)（1034）+TX、溴氰菊酯（223）+TX、田樂磷（1037）+TX、田樂磷-O（1037）+TX、田樂磷-S（1037）+TX、內吸磷（1038）+TX、內吸磷-甲基（224）+TX、內吸磷-O（1038）+TX、內吸磷-O-甲基（224）+TX、內吸磷-S（1038）+TX、內吸磷-S-甲基（224）+TX、內吸磷-S-甲基碸（1039）+TX、丁醚脲（226）+TX、氯亞胺硫磷（1042）+TX、二胺磷（1044）+TX、二嗪磷（227）+TX、異氯磷（1050）+TX、除線磷（1051）+TX、敵敵畏（236）+TX、迪克力弗斯（dicliphos）

（別名）+TX、迪克萊賽爾（dicresyl）（別名）[CCN]+TX、百治磷（243）+TX、地昔尼爾（244）+TX、狄氏劑（1070）+TX、二乙基 5-甲基吡唑-3-基 磷酸酯（IUPAC名稱）（1076）+TX、除蟲脲（250）+TX、二羥丙茶鹼（dilor）（別名）[CCN]+TX、四氟甲醚菊酯[CCN]+TX、甲氟磷（1081）+TX、地麥威（1085）+TX、樂果（262）+TX、苄菊酯（1083）+TX、甲基毒蟲畏（265）+TX、敵蠅威（1086）+TX、消蟎酚（1089）+TX、消蟎酚（dinex-diclexine）（1089）+TX、丙硝酚（1093）+TX、戊硝酚（1094）+TX、達諾殺（1095）+TX、呋蟲胺（271）+TX、苯蟲醚（1099）+TX、蔬果磷（1100）+TX、二氧威（1101）+TX、敵惡磷（1102）+TX、乙拌磷（278）+TX、苯噻乙雙硫磷（dithicrofos）（1108）+TX、DNOC（282）+TX、朵拉克汀（別名）[CCN]+TX、DSP（1115）+TX、蛻皮激素（別名）[CCN]+TX、EI 1642（發展代碼）（1118）+TX、甲氧基阿巴汀（291）+TX、甲氧基阿巴汀苯甲酸鹽（291）+TX、EMPC（1120）+TX、烯炔菊酯（292）+TX、硫丹（294）+TX、因毒磷（1121）+TX、異狄氏劑（1122）+TX、EPBP（1123）+TX、EPN（297）+TX、保幼醚（1124）+TX、依立諾克丁（別名）[CCN]+TX、高氰戊菊酯（302）+TX、牛津郡丙硫磷（etaphos）（別名）[CCN]+TX、乙硫苯威（308）+TX、乙硫磷（309）+TX、乙蟲腈（310）+TX、益硫磷-甲基（1134）+TX、滅線磷（312）+TX、甲酸乙酯（IUPAC名稱）[CCN]+TX、乙基-DDD（別名）（1056）+TX、二溴化乙烯（316）+TX、二氯化乙烯（化學名稱）（1136）+TX、環氧乙烷[CCN]+TX、醚菊酯（319）+TX、乙嘧硫磷（1142）+TX、EXD（1143）+TX、胺磺磷（323）+TX、苯線磷（326）+TX、抗蟎唑（1147）+TX、皮蠅磷（1148）+TX、苯硫威（1149）+TX、芬氟司林（1150）+TX、殺螟硫磷（335）+TX、丁苯威（336）+TX、噁醯蟲胺（fenoxacrim）（1153）+TX、苯氧威（340）+TX、吡氯氰菊酯（1155）+TX、甲氰菊酯（342）+TX、吡蟎胺（fenpyrad）（別名）

+TX、豐索磷（1158）+TX、倍硫磷（346）+TX、倍硫磷-乙基 [CCN]+TX、氰戊菊酯（349）+TX、氟蟲腈（354）+TX、氟啶蟲醯胺（358）+TX、氟蟲醯胺（CAS登記號：272451-65-7）+TX、伏康脲（flucofuron）（1168）+TX、氟環脲（366）+TX、氟氰戊菊酯（367）+TX、聯氟螨（1169）+TX、嘧蟲胺[CCN]+TX、氟蟲脲（370）+TX、三氟醚菊酯（1171）+TX、氟氯苯菊酯（372）+TX、氟胺氰菊酯（1184）+TX、FMC 1137（發展代碼）（1185）+TX、地蟲磷（1191）+TX、伐蟲脒（405）+TX、伐蟲脒鹽酸鹽（405）+TX、安硫磷（1192）+TX、藻螨威（formparanate）（1193）+TX、丁苯硫磷（1194）+TX、福司吡酯（1195）+TX、噻唑酮磷（408）+TX、丁硫環磷（1196）+TX、呋線威（412）+TX、抗蟲菊（1200）+TX、γ-氯氟氰菊酯（197）+TX、γ-HCH（430）+TX、雙胍鹽（422）+TX、雙胍醋酸鹽（422）+TX、GY-81（發展代碼）（423）+TX、苄螨醚（424）+TX、氯蟲醯肼（425）+TX、HCH（430）+TX、HEOD（1070）+TX、飛布達（1211）+TX、庚烯磷（432）+TX、速殺硫磷[CCN]+TX、氟鈴脲（439）+TX、HHDN（864）+TX、氟蟻腙（443）+TX、氫氰酸（444）+TX、烯蟲乙酯（445）+TX、海驅威（hyquincarb）（1223）+TX、吡蟲啉（458）+TX、炔咪菊酯（460）+TX、茚蟲威（465）+TX、碘甲烷（IUPAC名稱）（542）+TX、IPSP（1229）+TX、氯唑磷（1231）+TX、碳氯靈（1232）+TX、水胺硫磷（別名）（473）+TX、異艾氏劑（1235）+TX、異柳磷（1236）+TX、移栽靈（1237）+TX、異丙威（472）+TX、O-(甲氧基胺基硫代磷醯基)水楊酸異丙酯（IUPAC名稱）（473）+TX、稻瘟靈（474）+TX、異拌磷（1244）+TX、惡唑磷（480）+TX、艾弗麥克素 （別名）[CCN]+TX、茉酮菊素I（696）+TX、茉酮菊素II（696）+TX、碘硫磷（1248）+TX、保幼激素I（別名）[CCN]+TX、保幼激素II（別名）[CCN]+TX、保幼激素III（別名）[CCN]+TX、氯戊環（1249）+TX、烯蟲炔酯（484）+TX、λ-氯氟氰菊酯（198）+TX、砷酸鉛[CCN]+TX、

雷皮菌素（CCN）+ TX、對溴磷（1250）+ TX、林旦（430）+ TX、丙嘧硫磷（lirimfos）（1251）+ TX、虱螨脲（490）+ TX、噻唑磷（1253）+ TX、間異丙基苯基 甲基胺基甲酸酯（IUPAC名稱）（1014）+ TX、磷化鎂（IUPAC名稱）（640）+ TX、馬拉松 （492）+ TX、特螨腈（1254）+ TX、疊氮磷（1255）+ TX、滅加松（502）+ TX、四甲磷（1258）+ TX、滅蚜硫磷（1260）+ TX、地安磷（1261）+ TX、氯化亞汞（513）+ TX、線蟲靈（mesulfenfos）（1263）+ TX、氰氟蟲腙（CCN）+ TX、威百畝（519）+ TX、威百畝鉀（別名）（519）+ TX、威百畝鈉（519）+ TX、蟲螨畏（1266）+ TX、甲胺磷（527）+ TX、甲烷磺醯氟（IUPAC/化學文摘名稱）（1268）+ TX、殺撲磷（529）+ TX、滅賜克（530）+ TX、殺蟲乙烯磷（1273）+ TX、滅多威（531）+ TX、烯蟲酯（532）+ TX、甲喹丁（1276）+ TX、甲醚菊酯（別名）（533）+ TX、甲氧滴滴涕（534）+ TX、甲氧苯醯（535）+ TX、溴甲烷（537）+ TX、異硫氰酸甲酯（543）+ TX、甲基氯仿（別名）[CCN] + TX、二氯甲烷[CCN] + TX、甲氧苄氟菊酯[CCN] + TX、速滅威（550）+ TX、惡蟲酮（1288）+ TX、美文松 （556）+ TX、茲克威（1290）+ TX、密滅汀（557）+ TX、米爾倍黴素（別名）[CCN] + TX、丙胺氟磷（1293）+ TX、滅蟻靈（1294）+ TX、久效磷（561）+ TX、茂硫磷（1300）+ TX、莫昔克丁（別名）[CCN] + TX、萘酞磷（別名）[CCN] + TX、二溴磷（567）+ TX、萘（IUPAC/化學文摘名稱）（1303）+ TX、NC-170（發展代碼）（1306）+ TX、NC-184（化合物代碼）+ TX、煙鹼（578）+ TX、硫酸煙鹼（578）+ TX、氟蟻靈（1309）+ TX、烯啶蟲胺（579）+ TX、硝乙脲噻唑（nithiazine）（1311）+ TX、戊氰威（1313）+ TX、戊氰威1:1氯化鋅錯合物（1313）+ TX、NNI-0101（化合物代碼）+ TX、NNI-0250（化合物代碼）+ TX、降煙鹼（傳統名稱）（1319）+ TX、雙苯氟脲（585）+ TX、多氟脲（586）+ TX、O-5-二氯-4-碘苯基 O-乙基 乙基硫代膦酸酯（IUPAC名稱）（1057）+ TX、O,O-二乙基 O-4-甲基-2-側

氧基-2H-色烯-7-基 硫代膦酸酯（IUPAC名稱）（1074）+ TX、O,O-二乙基 O-6-甲基-2-丙基嘧啶-4-基 硫代膦酸酯（IUPAC名稱）（1075）+ TX、O,O,O',O'-四丙基 二硫代焦磷酸酯（IUPAC名稱）（1424）+ TX、油酸（IUPAC名稱）（593）+ TX、氧化樂果（594）+ TX、殺線威（602）+ TX、碸吸磷-甲基（609）+ TX、異亞碸磷（1324）+ TX、碸拌磷（1325）+ TX、pp'-DDT（219）+ TX、對-二氯苯[CCN] + TX、對硫磷（615）+ TX、對硫磷-甲基（616）+ TX、氟幼脲（別名）[CCN] + TX、五氯苯酚（623）+ TX、月桂酸五氯苯基酯（IUPAC名稱）（623）+ TX、氯菊酯（626）+ TX、石油油料類（別名）（628）+ TX、PH 60-38（發展代碼）（1328）+ TX、芬硫磷（1330）+ TX、苯醚菊酯（630）+ TX、稻豐散（631）+ TX、甲拌磷（636）+ TX、伏殺硫磷（637）+ TX、硫環磷（1338）+ TX、亞胺硫磷（638）+ TX、對氯硫磷（1339）+ TX、磷胺（639）+ TX、磷化氫（IUPAC名稱）（640）+ TX、辛硫磷（642）+ TX、辛硫磷-甲基（1340）+ TX、甲胺基嘧啶磷(pirimetaphos)（1344）+ TX、抗蚜威（651）+ TX、蟲螨磷-乙基（1345）+ TX、蟲螨磷-甲基（652）+ TX、聚氯二環戊二烯異構物類（IUPAC名稱）（1346）+ TX、聚氯萜類（傳統名稱）（1347）+ TX、亞砷酸鉀[CCN] + TX、硫氰酸鉀[CCN] + TX、丙炔菊酯（655）+ TX、早熟素I（別名）[CCN] + TX、早熟素II（別名）[CCN] + TX、早熟素III（別名）[CCN] + TX、乙醯嘧啶磷（primidophos）（1349）+ TX、丙溴磷（662）+ TX、丙氟菊酯[CCN] + TX、蜱虱威（1354）+ TX、猛殺威（1355）+ TX、丙蟲磷（1356）+ TX、胺丙畏（673）+ TX、殘殺威（678）+ TX、乙噻唑磷（1360）+ TX、丙硫磷（686）+ TX、發硫磷（1362）+ TX、丙苯烴菊酯（protrifenbute） [CCN] + TX、吡蚜酮（688）+ TX、吡唑硫磷（689）+ TX、定菌磷（693）+ TX、苄呋菊酯（pyresmethrin）（1367）+ TX、除蟲菊酯I（696）+ TX、除蟲菊酯II（696）+ TX、除蟲菊酯類（696）+ TX、噠螨靈（699）+ TX、啶蟲丙醚（700）+ TX、嗪吡硫磷（701）

+TX、嘧螨醚（706）+TX、嘧硫磷（1370）+TX、吡丙醚（708）+TX、苦木萃取物（quassia）（別名）[CCN] + TX、喹硫磷（quinalphos）（711）+ TX、喹硫磷-甲基（1376）+TX、畜寧磷（1380）+TX、喹硫磷（quintiofos）（1381）+TX、R-1492（發展代碼）（1382）+TX、雷複尼特（別名）[CCN]+TX、苄呋菊酯（719）+TX、魚藤酮（722）+TX、RU 15525（發展代碼）（723）+TX、RU 25475（發展代碼）（1386）+TX、尼亞那（ryania）（別名）（1387）+TX、利阿諾定（傳統名稱）（1387）+TX、沙巴藜蘆（別名）（725）+TX、八甲磷（1389）+TX、硫線磷（別名）+TX、塞拉菌素（別名）[CCN]+TX、SI-0009（化合物代碼）+TX、SI-0205（化合物代碼）+TX、SI-0404（化合物代碼）+TX、SI-0405（化合物代碼）+TX、氟矽菊酯（728）+TX、SN 72129（發展代碼）（1397）+TX、亞砷酸鈉[CCN] + TX、氰化鈉（444）+TX、氟化鈉（IUPAC/化學文摘名稱）（1399）+TX、六氟矽酸鈉（1400）+TX、五氯酚鈉（623）+TX、硒酸鈉（IUPAC名稱）（1401）+TX、硫氰酸鈉[CCN]+TX、蘇硫磷（1402）+TX、多殺菌素（737）+TX、螺甲螨酯（739）+TX、螺蟲乙酯（CCN）+TX、薩爾科福隆（sulcofuron）（746）+TX、薩爾科福隆鈉（sulcofuron-sodium）（746）+TX、氟蟲胺（750）+TX、治螟磷（753）+TX、磺醯氟（756）+TX、硫丙磷（1408）+TX、焦油類（別名）（758）+TX、τ-氟胺氰菊酯（398）+TX、噻螨威（1412）+TX、TDE（1414）+TX、蟲醯肼（762）+TX、吡螨胺（763）+TX、丁基嘧啶磷（764）+TX、氟苯脲（768）+TX、七氟菊酯（769）+TX、雙硫磷（770）+TX、TEPP（1417）+TX、環戊烯丙菊酯（1418）+TX、三級丁威（terbam）（別名）+TX、特丁硫磷（773）+TX、四氯乙烷[CCN]+TX、殺蟲畏（777）+TX、四甲菊酯（787）+TX、θ氯氰菊酯（204）+TX、噻蟲啉（791）+TX、塞芬諾克斯（thiafenox）（別名）+TX、噻蟲嗪（thiamethoxam）（792）+TX、苯噻硫磷（thicrofos）（1428）+TX、克蟲威（1431）+TX、殺

蟲環（798）+ TX、殺蟲環草酸氫鹽（798）+ TX、硫雙威（799）+ TX、久效威（800）+ TX、甲基乙拌磷（801）+ TX、蟲線磷（1434）+ TX、殺蟲單（thiosultap）（803）+ TX、殺蟲雙（thiosultap-sodium）（803）+ TX、蘇雲金素（別名）[CCN] + TX、唑蟲醯胺（809）+ TX、四溴菊酯（812）+ TX、四氟苯菊酯（813）+ TX、反式苄氯菊酯（transpermethrin）（1440）+ TX、威菌磷（1441）+ TX、唑蚜威（818）+ TX、三唑磷（820）+ TX、唑呀威（別名）+ TX、敵百蟲（824）+ TX、三氯偏磷酸-3（trichlormetaphos-3）（別名）[CCN] + TX、毒壤膦（1452）+ TX、三氯丙氧磷（1455）+ TX、殺鈴脲（835）+ TX、混殺威（840）+ TX、烯蟲硫酯（1459）+ TX、蚜滅磷（847）+ TX、甲烯氟蟲腈（vaniliprole） [CCN] + TX、藜蘆定（別名）（725）+ TX、藜蘆鹼（別名）（725）+ TX、XMC（853）+ TX、滅殺威（854）+ TX、YI-5302（化合物代碼）+ TX、ζ-氯氰菊酯（205）+ TX、澤泰咪林（zetamethrin）（別名）+ TX、磷化鋅（640）+ TX、丙硫惡唑磷（zolaprofos）（1469）以及ZXI 8901（發展代碼）（858）+ TX、氰蟲醯胺[736994-63-19] + TX、氯蟲醯胺[500008-45-7] + TX、唑螨氰（cyenopyrafen）[560121-52-0] + TX、丁氟螨酯[400882-07-7] + TX、氟蟲吡喹（pyrifluquinazon）[337458-27-2] + TX、乙基多殺菌素（spinetoram）[187166-40-1 + 187166-15-0] + TX、螺蟲乙酯[203313-25-1] + TX、碸蟲啶（sulfoxaflor）[946578-00-3] + TX、丁蟲腈（flufiprole）[704886-18-0] + TX、氯氟醚菊酯[915288-13-0] + TX、四氟醚菊酯（tetramethylfluthrin）[84937-88-2] + TX、triflumezopyrim（揭露於WO 2012/092115中）+ TX、fluxametamide（WO 2007/026965）+ TX、ε-美特寧（epsilon-metofluthrin）[240494-71-7] + TX、ε-momfluorothrin[1065124-65-3] + TX、氟炔丙菊酯（fluazaindolizine）[1254304-22-7] + TX、氯炔丙菊酯（chloroprallethrin）[399572-87-3] + TX、fluxametamide [928783-29-3] + TX、氯氟氰蟲醯胺（cyhalodiamide）[1262605-53-7] + TX、tioxazafen [330459-31-9] + TX、雙醯胺

殺蟲劑（broflanilide）[1207727-04-5]＋TX、丁烯氟蟲腈[704886-18-0]＋TX、環溴蟲醯胺[1031756-98-5]＋TX、氟氰蟲醯胺（tetraniliprole）[1229654-66-3]＋TX、戊吡蟲胍（描述在WO2010/060231中）＋TX、環氧蟲啶（描述在WO2005/077934中）＋TX，

【0320】 殺軟體動物劑，該殺軟體動物劑選自由以下物質組成之群組：二(三丁基錫)氧化物（IUPAC名稱）（913）＋TX、溴乙醯胺[CCN]＋TX、砷酸鈣[CCN]＋TX、除線威（cloethocarb）（999）＋TX、乙醯亞砷酸銅[CCN]＋TX、硫酸銅（172）＋TX、三苯錫（347）＋TX、磷酸鐵（IUPAC名稱）（352）＋TX、四聚乙醛（518）＋TX、滅賜克（530）＋TX、氯硝柳胺（576）＋TX、氯硝柳胺乙醇胺鹽（576）＋TX、五氯酚（623）＋TX、五氯苯氧化鈉（623）＋TX、噻螨威（tazimcarb）（1412）＋TX、硫雙威（799）＋TX、三丁基氧化錫（913）＋TX、殺螺味啉（trifenmorph）（1454）＋TX、混殺威（trimethacarb）（840）＋TX、乙酸三苯基錫（IUPAC名稱）（347）和三苯基氫氧化錫（IUPAC名稱）（347）＋TX、皮瑞普（pyriprole）[394730-71-3]＋TX，

【0321】 殺線蟲劑，該殺線蟲劑選自由以下物質組成之群組：AKD-3088（化合物代碼）＋TX、1,2-二溴-3-氯丙烷（IUPAC/化學文摘名）（1045）＋TX、1,2-二氯丙烷（IUPAC/化學文摘名）（1062）＋ TX、1,2-二氯丙烷與1,3-二氯丙烯（IUPAC名稱）（1063）＋TX、1,3-二氯丙烯（233）＋TX、3,4-二氯四氫噻吩1,1-二氧化物（IUPAC/化學文摘名）（1065）＋TX、3-(4-氯苯基)-5-甲基玫瑰寧（IUPAC名稱）（980）＋ TX、5-甲基-6-硫代-1,3,5-噻二𠯿吡-3-基乙酸（IUPAC名稱）（1286）＋TX、6-異戊烯基胺基嘌呤（別名）（210）＋TX、阿巴美丁（1）＋TX、乙醯蟲腈[CCN]＋TX、棉鈴威（15）＋TX、涕滅威（aldicarb）（16）＋TX、涕滅砜威（aldoxycarb）（863）＋TX、AZ 60541（化合物代碼）＋TX、benclothiaz[CCN]＋TX、苯菌靈（62）＋TX、丁基噠螨酮（butylpyridaben）（別名）＋TX、

硫線磷（cadusafos）（109）+ TX、克百威（carbofuran）（118）+ TX、二硫化碳（945）+ TX、丁硫克百威（119）+ TX、氯化苦（141）+ TX、毒死蜱（145）+ TX、除線威（cloethocarb）（999）+ TX、細胞分裂素（cytokinins）（別名）（210）+ TX，棉隆（216）+ TX、DBCP（1045）+ TX、DCIP（218）+ TX、除線特（diamidafos）（1044）+ TX、除線磷（dichlofenthion）（1051）+ TX、二克磷（dicliphos）（別名）+ TX、樂果（262）+ TX、依馬克丁（別名）[CCN] + TX、苯甲酸依馬克丁（291）+ TX、依立諾克丁（291）+ TX、（別名）[CCN] + TX、滅線磷（312）+ TX、二溴乙烷（316）+ TX、苯線磷（fenamiphos）（326）+ TX、吡螨胺（別名）+ TX、豐索磷（fenpyrad）（1158）+ TX、噻唑磷（fosthiazate）（408）+ TX、丁硫環磷（fosthietan）（1196）+ TX、糠醛（別名）[CCN] + TX、GY-81（發展代碼）（423）+ TX、速殺硫磷（heterophos）[CCN] + TX、碘甲烷（IUPAC名稱）（542）+ TX、isamidofos（1230）+ TX、氯唑磷（isazofos）（1231）+ TX、伊維菌素（替代名稱）[CCN] + TX、激動素（kinetin）（別名）（210）+ TX、甲基滅蚜磷（mecarphon）（1258）+ TX、威百畝（519）+ TX、威百畝鉀鹽（別名）（519）+ TX、威百畝鈉鹽（519）+ TX、甲基溴（537）+ TX、異硫氰酸甲酯（543）+ TX、殺蟎菌素肟（milbemycin oxime）（別名）[CCN] + TX、莫昔克丁（剔名）[CCN] + TX、疣孢漆斑菌（Myrothecium verrucaria）組分（別名）（565）+ TX、NC-184（化合物代碼）+ TX、殺線威（602）+ TX、甲拌磷（636）+ TX、磷胺（639）+ TX、磷蟲威（phosphocarb）[CCN] + TX、硫線磷（sebufos）（別名）+ TX、塞拉菌素（selamectin）（別名）[CCN] + TX、多殺菌素（737）+ TX、三級丁威（terbam）（別名）+ TX、特丁磷（terbufos）（773）+ TX、四氯噻吩（IUPAC/化學文摘名）（1422）+ TX、賽菲農（thiaf enox）（別名）+ TX、蟲線磷（thionazin）（1434）+ TX、三唑磷（triazophos）（820）+ TX、triazuron（別名）+ TX、二甲苯酚[CCN] + TX、YI-5302（化合物代碼）和玉米

素（別名）（210）+ TX、fluensulfone [318290-98-1] + TX，

【0322】 硝化作用抑制劑，該硝化作用抑制劑選自由以下物質組成之群組：乙基黃原酸鉀[CCN]以及氯啶（nitrapyrin）（580）+TX，

【0323】 植物活化劑，該植物活化劑選自由以下物質組成之群組：噻二唑素（acibenzolar）（6）+ TX、噻二唑素-S-甲基（6）+ TX、烯丙苯噻唑（probenazole）（658）和大虎杖（Reynoutria sachalinensis）萃取物（別名）（720）+ TX，

【0324】 殺鼠劑，該殺鼠劑選自由以下物質組成之群組：2-異戊醯二氫茚-1,3-二酮（IUPAC名稱）（1246）+ TX、4-(喹噁啉-2-基胺基)苯磺醯胺（IUPAC名稱）（748）+ TX、α-氯代醇[CCN] + TX、磷化鋁（640）+ TX、安妥（880）+ TX、三氧化二砷（882）+ TX、碳酸鋇（891）+ TX、雙鼠脲（912）+ TX、溴鼠隆（89）+ TX、溴敵隆（91）+ TX、溴鼠胺（92）+ TX、氰化鈣（444）+ TX、氯醛糖（127）+ TX、氯鼠酮（140）+ TX、維生素D3（別名）（850）+ TX、氯滅鼠靈（1004）+ TX、克滅鼠（1005）+ TX、殺鼠萘（175）+ TX、殺鼠嘧啶（1009）+ TX、鼠得克（246）+ TX、噻鼠靈（249）+ TX、敵鼠鈉（273）+ TX、維生素D2（301）+ TX、氟鼠靈（357）+ TX、氟乙醯胺（379）+ TX、鼠樸定（1183）+ TX、鹽酸鼠樸定（1183）+ TX、γ-HCH（430）+ TX、HCH（430）+ TX、氫氰酸（444）+ TX、碘甲烷（IUPAC名稱）（542）+ TX、林旦（430）+ TX、磷化鎂（IUPAC名稱）（640）+ TX、甲基溴（537）+ TX、鼠特靈（1318）+ TX、毒鼠磷（1336）+ TX、磷化氫（IUPAC名稱）（640）+ TX、磷[CCN] + TX、殺鼠酮（1341）+ TX、亞砷酸鉀 [CCN] + TX、滅鼠優（1371）+ TX、海蔥糖苷（1390）+ TX、亞砷酸鈉 [CCN] + TX、氰化鈉（444）+ TX、氟-乙酸鈉（735）+ TX、士的寧（745）+ TX、硫酸鉈 [CCN] + TX、殺鼠靈（851）以及磷化鋅（640）+ TX，

【0325】 增效劑，該增效劑選自由以下物質組成之群組：2-(2-丁氧基乙氧

基)-乙基胡椒基酯（IUPAC名稱）（934）+ TX、5-(1,3-苯并二氧雜環戊烯-5-基)-3-已基環已-2-烯酮（IUPAC名稱）（903）+ TX、具有橙花三級醇的菌綠烯醇（別名）（324）+ TX、MB-599（發展代碼）（498）+ TX、MGK 264（發展代碼）（296）+ TX、增效醚（piperonyl butoxide）（649）+ TX、增效醛（piprotal）（1343）+ TX、增效酯（propyl isomer）（1358）+ TX、S421（發展代碼）（724）+ TX、增效散（sesamex）（1393）+ TX、芝麻林素（sesasmolin）（1394）和亞碸（1406）+ TX，

【0326】 動物驅避劑，該動物驅避劑選自由以下物質組成之群組：蔥醌（32）+ TX、氯醛糖（127）+ TX、環烷酸銅 [CCN] + TX、王銅（171）+ TX、二嗪磷（227）+ TX、二環戊二烯（化學名稱）（1069）+ TX、雙胍鹽（guazatine）（422）+ TX、雙胍醋酸鹽（422）+ TX、滅賜克（530）+ TX、吡啶-4-胺（IUPAC名稱）（23）+ TX、塞侖（804）+ TX、混殺威（trimethacarb）（840）+ TX、環烷酸鋅[CCN]和福美鋅（856）+ TX，

【0327】 殺病毒劑，該殺病毒劑選自由以下物質組成之群組：衣馬寧（別名）[CCN] 和利巴韋林（別名）[CCN] + TX，

【0328】 創傷保護劑，該創傷保護劑選自由以下物質組成之群組：氧化汞（512）+ TX、辛噻酮（590）和甲基硫菌靈（802）+ TX，

【0329】 以及生物活性化合物，這些化合物選自由以下物質組成之群組：阿紮康唑[60207-31-0] + TX、聯苯三唑醇[70585-36-3] + TX、糠菌唑[116255-48-2] + TX、環唑醇[94361-06-5] + TX、苯醚甲環唑[119446-68-3] + TX、烯唑醇[83657-24-3] + TX、氟環唑[106325-08-0] + TX、腈苯唑[114369-43-6] + TX、氟唑[136426-54-5] + TX、氟矽唑[85509-19-9] + TX、粉唑醇[76674-21-0] + TX、己唑醇[79983-71-4] + TX、抑黴唑[35554-44-0] + TX、亞胺唑[86598-92-7] + TX、種菌唑[125225-28-7] + TX、葉菌唑[125116-23-6] + TX、腈菌唑[88671-89-0] +

TX、稻瘟酯[101903-30-4] + TX、戊菌唑[66246-88-6] + TX、丙硫菌唑[178928-70-6] + TX、啶斑肟（pyrifenox）[88283-41-4] + TX、丙氯靈[67747-09-5] + TX、丙環唑[60207-90-1] + TX、矽氟唑（simeconazole）[149508-90-7] + TX、戊唑醇[107534-96-3] + TX、氟醚唑[112281-77-3] + TX、三唑酮[43121-43-3] + TX、三唑酮[55219-65-3] + TX、氟菌唑[99387-89-0] + TX、滅菌唑[131983-72-7] + TX、三環苯嘧醇[12771-68-5] + TX、氯苯嘧啶醇[60168-88-9] + TX、氟氯苯嘧啶醇[63284-71-9] + TX、乙嘧酚磺酸酯（bupirimate）[41483-43-6] + TX、甲菌定（dimethirimol）[5221-53-4] + TX、乙菌定（ethirimol）[23947-60-6] + TX、十二環味啉[1593-77-7] + TX、苯鏽啶（fenpropidine）[67306-00-7] + TX、丁苯味啉[67564-91-4] + TX、螺環菌胺[118134-30-8] + TX、十三味啉[81412-43-3] + TX、嘧菌環胺[121552-61-2] + TX、嘧菌胺[110235-47-7] + TX、嘧黴胺（pyrimethanil）[53112-28-0] + TX、拌種咯[74738-17-3] + TX、咯菌腈（fludioxonil）[131341-86-1] + TX、苯霜靈（benalaxyl）[71626-11-4] + TX、呋霜靈（furalaxyl）[57646-30-7] + TX、甲霜靈[57837-19-1] + TX、R甲霜靈[70630-17-0] + TX、呋醯胺[58810-48-3] + TX、惡霜靈（Oxadixyl）[77732-09-3] + TX、苯菌靈[17804-35-2] + TX、多菌靈[10605-21-7] + TX、咪菌威（debacarb）[62732-91-6] + TX、麥穗寧[3878-19-1] + TX、噻苯達唑[148-79-8] + TX、乙菌利（chlozolinate）[84332-86-5] + TX、菌核利（dichlozoline）[24201-58-9] + TX、異菌脲（Iprodione）[36734-19-7] + TX、myclozoline[54864-61-8] + TX、腐黴利（procymidone）[32809-16-8] + TX、乙烯菌核利（vinclozoline）[50471-44-8] + TX、啶醯菌胺（boscalid）[188425-85-6] + TX、萎鏽靈[5234-68-4] + TX、甲呋醯苯胺[24691-80-3] + TX、氟醯胺（Flutolanil）[66332-96-5] + TX、滅鏽胺[55814-41-0] + TX、氧化萎鏽靈[5259-88-1] + TX、吡噻菌胺（penthiopyrad）[183675-82-3] + TX、噻呋菌胺[130000-40-7] + TX、雙胍鹽[108173-90-6] + TX、多果定（dodine）[2439-10-3][112-65-2]（游離鹼）+ TX、

雙胍辛胺（iminoctadine）[13516-27-3] + TX、嘧菌酯[131860-33-8] + TX、醚菌胺[149961-52-4] + TX、烯肟菌酯 {Proc.BCPC，Int. Congr.，Glasgow. 2003，1，93} + TX、氟嘧菌酯[361377-29-9] + TX、甲基醚菌酯[143390-89-0] + TX、苯氧菌胺[133408-50-1] + TX、肟菌酯[141517-21-7] + TX、肟醚菌胺[248593-16-0] + TX、啶氧菌酯[117428-22-5] + TX、吡唑醚菌酯 [175013-18-0] + TX、福美鐵[14484-64-1] + TX、代森錳鋅[8018-01-7] + TX、代森錳[12427-38-2] + TX、代森聯[9006-42-2] + TX、甲代森鋅（propineb）[12071-83-9] + TX、塞侖[137-26-8] + TX、代森鋅[12122-67-7] + TX、福美鋅[137-30-4] + TX、敵菌丹（captafol）[2425-06-1] + TX、克菌丹[133-06-2] + TX、苯氟磺胺[1085-98-9] + TX、唑啶草（fluoroimide）[41205-21-4] + TX、滅菌丹[133-07-3] + TX、甲苯氟磺胺[731-27-1] + TX、波爾多（bordeaux）混合物[8011-63-0] + TX、氫氧化銅（copperhydroxid）[20427-59-2] + TX、氯化銅（copperoxychlorid）[1332-40-7] + TX、硫酸銅（coppersulfat）[7758-98-7] + TX、氧化銅（copperoxid）[1317-39-1] + TX、代森錳銅（mancopper）[53988-93-5] + TX、喹啉銅（oxine-copper）[10380-28-6] + TX、敵螨普（dinocap）[131-72-6] + TX、酞菌酯（nitrothal-isopropyl）[10552-74-6] + TX、克瘟散[17109-49-8] + TX、異稻瘟淨（iprobenphos）[26087-47-8] + TX、稻瘟靈（isoprothiolane）[50512-35-1] + TX、氯瘟磷（phosdiphen）[36519-00-3] + TX、克菌磷（pyrazophos）[13457-18-6] + TX、甲基托氯磷（tolclofos-methyl）[57018-04-9] + TX、苯并噻二唑（acibenzolar-S-methyl）[135158-54-2] + TX、敵菌靈[101-05-3] + TX、苯噻菌胺[413615-35-7] + TX、滅瘟素（blasticidin）-S[2079-00-7] + TX、滅螨猛（chinomethionat）[2439-01-2] + TX、地茂散（chloroneb）[2675-77-6] + TX、百菌清[1897-45-6] + TX、環氟菌胺[180409-60-3] + TX、霜脲氰[57966-95-7] + TX、二氯萘醌（dichlone）[117-80-6] + TX、雙氯氰菌胺（diclocymet）[139920-32-4] + TX、噠菌酮（diclomezine）[62865-36-5] +

TX、氯硝胺（dicloran）[99-30-9] + TX、乙霧威（diethofencarb）[87130-20-9] + TX、烯醯味啉[110488-70-5] + TX、SYP-LI90（Flumorph）[211867-47-9] + TX、二噻農（dithianon）[3347-22-6] + TX、噻唑菌胺（ethaboxam）[162650-77-3] + TX、土菌靈（etridiazole）[2593-15-9] + TX、惡唑菌酮[131807-57-3] + TX、咪唑菌酮（fenamidone）[161326-34-7] + TX、稻瘟醯胺（Fenoxanil）[115852-48-7] + TX、三苯錫（fentin）[668-34-8] + TX、嘧菌腙（ferimzone）[89269-64-7] + TX、氟啶胺（fluazinam）[79622-59-6] + TX、氟吡菌胺（fluopicolide）[239110-15-7] + TX、磺菌胺（flusulfamide）[106917-52-6] + TX、環醯菌胺[126833-17-8] + TX、福賽得（fosetyl-aluminium）[39148-24-8] + TX、惡霧靈（hymexazol）[10004-44-1] + TX、丙森鋅[140923-17-7] + TX、IKF-916（賽座滅（Cyazofamid））[120116-88-3] + TX、春雷霧素（kasugamycin）[6980-18-3] + TX、磺菌威（methasulfocarb）[66952-49-6] + TX、苯菌酮[220899-03-6] + TX、戊菌隆（pencycuron）[66063-05-6] + TX、苯酞[27355-22-2] + TX、多氧霧素（polyoxins）[11113-80-7] + TX、噻菌靈（probenazole）[27605-76-1] + TX、百維威（propamocarb）[25606-41-1] + TX、碘喹唑酮（proquinazid）[189278-12-4] + TX、樂喹酮（pyroquilon）[57369-32-1] + TX、喹氧靈[124495-18-7] + TX、五氯硝苯[82-68-8] + TX、硫[7704-34-9] + TX、噻醯菌胺[223580-51-6] + TX、咪唑啩（triazoxide）[72459-58-6] + TX、三環唑[41814-78-2] + TX、嗪胺靈（triforine）[26644-46-2] + TX、有效霧素[37248-47-8] + TX、苯醯菌胺（zoxamide）（RH7281）[156052-68-5] + TX、雙炔醯菌胺（mandipropamid）[374726-62-2] + TX、吡蚜酮（isopyrazam）[881685-58-1] + TX、塞德因（sedaxane）[874967-67-6] + TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸(9-二氯亞甲基-1,2,3,4-四氫-1,4-甲橋-萘-5-基)-醯胺（揭露於WO 2007/048556中） + TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸(3',4',5'-三氟-聯苯基-2-基)-醯胺（揭露於WO 2006/087343中） + TX、[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[(環丙基羰

基)氧基]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氫-6,12-二羥基-4,6a,12b-三甲基-11-側氧基-9-(3-吡啶基)-2H,11H萘并[2,1-b]哌喃并[3,4-e]哌喃-4-基]甲基-環丙甲酸酯[915972-17-7] + TX以及1,3,5-三甲基-N-(2-甲基-1-氧丙基)-N-[3-(2-甲基丙基)-4-[2,2,2-三氟-1-甲氧基-1-(三氟甲基)乙基]苯基]-1H-吡唑-4-甲醯胺[926914-55-8] + TX；lancotrione [1486617-21-3] + TX、氯氟吡啶酯[943832-81-3] + TX、ipfentrifluconazole [1417782-08-1] + TX、mefentrifluconazole [1417782-03-6] + TX、quinofumelin [861647-84-9] + TX、右旋反式氯丙炔菊酯[399572-87-3] + TX、氯氟氰蟲醯胺[1262605-53-7] + TX、三氟咪啶醯胺[1254304-22-7] + TX、fluxametamide [928783-29-3] + TX、ε-甲氧苄氟菊酯[240494-71-7] + TX、epsilon-momfluorothrin [1065124-65-3] + TX、氟唑菌醯羥胺（pydiflumetofen）[1228284-64-7] + TX、κ-聯苯菊酯[439680-76-9] + TX、broflanilide [1207727-04-5] + TX、dicloromezotiaz [1263629-39-5] + TX、敵派美創（dipymetitrone）[16114-35-5] + TX、pyraziflumid [942515-63-1] + TX、κ-七氟菊酯[391634-71-2] + TX；fenpicoxamid [517875-34-2] + TX；fluindapyr [1383809-87-7] + TX；α-溴敵隆 [28772-56-7] + TX；flupyrimin [1689566-03-7] + TX；benzpyrimoxan [1449021-97-9] + TX；acynonapyr [1332838-17-1] + TX；inpyrfluxam [1352994-67-2] + TX、isoflucypram [1255734-28-1] + TX；rescalure [64309-03-1] + TX；aminopyrifen [1531626-08-0] + TX；tyclopyrazoflor [1477919-27-9] + TX；和spiropidion [1229023-00-0] + TX；以及

【0330】 微生物劑，包括：魯氏不動桿菌 + TX、交替枝頂孢（Acremonium alternatum）+ TX + TX、頂頭孢黴（Acremonium cephalosporium）+ TX + TX、Acremonium diospyri + TX、Acremonium obclavatum + TX、棉褐帶卷蛾顆粒體病毒（AdoxGV）（Capex®）+ TX、放射形土壤桿菌菌株K84（Galltrol-A®）+ TX、互隔鏈格孢 + TX、決明鏈格孢（Alternaria cassia）+ TX、損毀鏈格孢（Smolder®）

+ TX、白粉寄生孢（AQ10®）+ TX、黃麴黴AF36（AF36®）+ TX、黃麴黴NRRL 21882（Aflaguard®）+ TX、麴黴屬+ TX、出芽短梗黴+ TX、固氮螺菌屬 + TX、（MicroAZ® + TX、TAZO B®）+ TX、固氮菌屬+ TX、圓褐固氮菌（Azotomeal®）+ TX、孢囊固氮菌（Bionatural Blooming Blossoms®）+ TX、解澱粉芽孢桿菌 + TX、蠟樣芽孢桿菌 + TX、原生祛病芽孢桿菌（Bacillus chitinosporus）菌株CM-1 + TX、原生祛病芽孢桿菌菌株AQ746 + TX、地衣芽孢桿菌菌株HB-2（Biostart™ Rhizoboost®）+ TX、地衣芽孢桿菌菌株3086（EcoGuard® + TX、Green Releaf®）+ TX、環狀芽孢桿菌 + TX、堅硬芽孢桿菌（BioSafe® + TX、BioNem-WP® + TX、VOTiVO®）+ TX、堅硬芽孢桿菌菌株I-1582 + TX、浸麻芽孢桿菌+ TX、Bacillus marismortui + TX、巨大芽孢桿菌+ TX、蕈狀芽孢桿菌菌株AQ726 + TX、日本甲蟲芽孢桿菌（Milky Spore Powder®）+ TX、短小芽孢桿菌屬+ TX、短小芽孢桿菌菌株GB34（Yield Shield®）+ TX、短小芽孢桿菌菌株AQ717 + TX、短小芽孢桿菌菌株QST 2808（Sonata® + TX、Ballad Plus®）+ TX、球形芽孢桿菌（VectoLex®）+ TX、芽孢桿菌屬 + TX、芽孢桿菌屬菌株AQ175 + TX、芽孢桿菌屬菌株AQ177 + TX、芽孢桿菌屬菌株AQ178 + TX、枯草芽孢桿菌菌株QST 713（CEASE® + TX、Serenade® + TX、Rhapsody®）+ TX、枯草芽孢桿菌菌株QST 714（JAZZ®）+ TX、枯草芽孢桿菌菌株AQ153 + TX、枯草芽孢桿菌菌株AQ743 + TX、枯草芽孢桿菌菌株QST3002 + TX、枯草芽孢桿菌菌株QST3004 + TX、枯草芽孢桿菌解澱粉變種菌株FZB24（Taegro® + TX、Rhizopro®）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌Cry 2Ae + TX、蘇雲金芽孢桿菌Cry1Ab + TX、蘇雲金芽孢桿菌鯰澤亞種（Bacillus thuringiensis aizawai）GC 91（Agree®）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌以色列亞種（Bacillus thuringiensis israelensis）（BMP123® + TX、Aquabac® + TX、VectoBac®）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克亞種（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、蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克亞種 BMP 123（Baritone®）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克亞種 HD-1（Bioprotec-CAF / 3P®）+ TX、蘇雲金芽孢桿菌菌株BD#32 + TX、蘇雲金芽孢桿菌菌株AQ52 + TX、蘇雲金芽孢桿菌鯰澤變種（XenTari® + TX、DiPel®）+ TX、細菌屬（GROWMEND® + TX、GROWSWEET® + TX、Shootup®）+ TX、密執安棍狀桿菌（Clavipacter michiganensis）的噬菌體（AgriPhage®）+ TX、Bakflor® + TX、球孢白僵菌（Beaugenic® + TX、Brocaril WP®）+ TX、球孢白僵菌GHA（Mycotrol ES® + TX、Mycotrol O® + TX、BotaniGuard®）+ TX、布氏白僵菌（Engerlingspilz® + TX、Schweizer Beauveria® + TX、Melocont®）+ TX、白僵菌屬 + TX、灰葡萄孢黴+ TX、大豆慢生型根瘤菌（TerraMax®）+ TX、短短小芽孢桿菌+ TX、蘇雲金芽孢桿菌擬步行甲亞種（Bacillus thuringiensis tenebrionis）（Novodor®）+ TX、BtBooster + TX、洋蔥伯克霍爾德菌（Deny® + TX、Intercept® + TX、Blue Circle®）+ TX、伯克霍爾德菌（Burkholderia gladii）+ TX、唐菖蒲伯克霍爾德菌 + TX、伯克霍爾德菌屬 + TX、加拿大薊真菌（CBH Canadian Bioherbicide®）+ TX、乳酪假絲酵母 + TX、無名假絲酵母 + TX、Candida fructus + TX、光滑念珠菌 + TX、吉利蒙念珠菌（Candida guilliermondii）+ TX、口津假絲酵母 + TX、橄欖假絲酵母菌株O + TX、近平滑假絲酵母 + TX、菌膜假絲酵母 + TX、鐵紅假絲酵母 + TX、拉考夫假絲酵母（Candida reukaufii）+ TX、齊藤假絲酵母（Candida saitoana）（Bio-Coat® + TX、Biocure®）+ TX、清酒假絲酵母 + TX、假絲酵母屬 + TX、纖細假絲酵母 + TX、戴氏西地西菌（Cedecea dravisae）+ TX、產黃纖維單胞菌 + TX、螺卷毛殼（Nova-Cide®）+ TX、球毛殼菌（Nova-Cide®）+ TX、鐵杉紫色桿菌（Chromobacterium subtsugae）菌株PRAA4-1T（Grandevo®）+ TX、枝狀枝孢菌 + TX、尖孢枝孢+ TX、Cladosporium chlorocephalum + TX、

枝孢屬 + TX、極細枝孢黴 + TX、粉紅黏帚黴（EndoFine®）+ TX、尖孢炭疽菌（Colletotrichum acutatum）+ TX、盾殼黴（Cotans WG®）+ TX、盾殼黴屬 + TX、淺白隱球酵母（YIELDPLUS®）+ TX、土生隱球菌 + TX、Cryptococcus infirmo-miniatus + TX、羅倫隱球酵母 + TX、蘋果異形小卷蛾顆粒體病毒（Cryptex®）+ TX、坎平貪銅菌（Cupriavidus campinensis）+ TX、蘋果蠹蛾顆粒體病毒（CYD-X®）+ TX、蘋果蠹蛾顆粒體病毒（Madex® + TX、Madex Plus® + TX、Madex Max/ Carpovirusine®）+ TX、Cylindrobasidium laeve（Stumpout®）+ TX、枝雙孢黴屬 + TX、漢遜德巴厘酵母 + TX、Drechslera hawaiinensis + TX、陰溝腸桿菌 + TX、腸桿菌科 + TX、毒力蟲黴（Vektor®）+ TX、黑附球菌（Epicoccum nigrum）+ TX、黑附球菌（Epicoccum purpurascens）+ TX、附球菌屬 + TX、花狀線黑粉菌（Filobasidium floriforme）+ TX、銳頂鐮孢菌 + TX、厚垣鐮孢黴 + TX、尖鐮孢（Fusaclean® / Biofox C®）+ TX、層生鐮孢 + TX、鐮孢屬 + TX、溶磷白地黴（Galactomyces geotrichum）+ TX、鏈孢黏帚黴（Primastop® + TX、Prestop®）+ TX、粉紅黏帚黴 + TX、黏帚黴屬（SoilGard®）+ TX、綠色黏帚黴（Soilgard®）+ TX、顆粒體病毒屬（Granupom®）+ TX、嗜鹽鹽芽孢桿菌（Halobacillus halophilus）+ TX、沿岸鹽芽孢桿菌（Halobacillus litoralis）+ TX、特氏鹽芽孢桿菌（Halobacillus trueperi）+ TX、鹽單胞菌屬 + TX、冰下鹽單胞菌（Halomonas subglaciescola）+ TX、鹽弧菌變型（Halovibrio variabilis）+ TX、葡萄汁有孢漢遜酵母 + TX、棉鈴蟲核型多角體病毒（Helicovex®）+ TX、玉米穗蟲核型多角體病毒（Gemstar®）+ TX、異黃酮-芒柄花黃素（Myconate®）+ TX、檸檬克勒克酵母 + TX、克勒克酵母屬 + TX、大鏈壺菌（Lagenidium giganteum）（Laginex®）+ TX、長孢蠟蚧菌（Lecanicillium longisporum）（Vertiblast®）+ TX、蠟蚧輪枝菌（Lecanicillium muscarium）（Vertikil®）+ TX、舞毒蛾核多角體病毒（Disparvirus®）+ TX、嗜鹽海球菌 +

TX、格氏梅拉菌（Meira geulakonigii）+ TX、綠僵菌（Met52®）+ TX、綠僵菌（Destruxin WP®）+ TX、Metschnikowia fruticola（Shemer®）+ TX、美極梅奇酵母（Metschnikowia pulcherrima）+ TX、Microdochium dimerum（Antibot®）+ TX、藍色小單孢菌（Micromonospora coerulea）+ TX、Microsphaeropsis ochracea + TX、Muscodor albus 620（Muscudor®）+ TX、Muscodor roseus菌株A3-5 + TX、菌根屬（Mycorrhizae spp.）（AMykor® + TX、Root Maximizer®）+ TX、疣孢漆斑菌菌株AARC-0255（DiTera®）+ TX、BROS PLUS® + TX、Ophiostoma piliferum菌株D97（Sylvanex®）+ TX、粉質擬青黴（Paecilomyces farinosus）+ TX、玫煙色擬青黴（PFR-97® + TX、PreFeRal®）+ TX、淡紫擬青黴（Paecilomyces linacinus）（Biostat WP®）+ TX、淡紫擬青黴菌株251（MeloCon WG®）+ TX、多黏類芽孢桿菌 + TX、成團泛菌（BlightBan C9-1®）+ TX、泛菌屬 + TX、巴斯德氏芽菌屬（Econem®）+ TX、Pasteuria nishizawae + TX、黃灰青黴+ TX、Penicillium billai（Jumpstart® + TX、TagTeam®）+ TX、短密青黴 + TX、常現青黴 + TX、灰黃青黴 + TX、產紫青黴 + TX、青黴菌屬 + TX、純綠色肯黴+ TX、大伏革菌（Phlebiopsis gigantean）（Rotstop®）+ TX、解磷細菌（Phosphomeal®）+ TX、隱地疫黴 + TX、棕櫚疫黴（Devine®）+ TX、異常畢赤酵母 + TX、Pichia guilermondii + TX、膜醭畢赤氏酵母 + TX、指甲畢赤酵母 + TX、樹幹畢赤酵母 + TX、銅綠假單胞菌 + TX、致金色假單胞菌（Pseudomonas aureofasciens）（Spot-Less Biofungicide®）+ TX、洋蔥假單胞菌 + TX、綠針假單胞菌（AtEze®）+ TX、皺褶假單胞菌（Pseudomonas corrugate）+ TX、螢光假單胞菌菌株A506（BlightBan A506®）+ TX、惡臭假單胞菌 + TX、Pseudomonas reactans + TX、假單胞菌屬 + TX、丁香假單胞菌（Bio-Save®）+ TX、綠黃假單胞菌 + TX、螢光假單胞菌（Zequanox®）+ TX、Pseudozyma flocculosa菌株PF-A22 UL（Sporodex L®）+ TX、縱溝柄鏽菌（Puccinia canaliculata）+ TX、Puccinia thlaspeos（Wood

Warrior®）+ TX、側雄腐黴菌（Pythium paroecandrum）+ TX、寡雄腐黴（Polygandron® + TX、Polyversum®）+ TX、纏器腐黴 + TX、水生拉恩菌（Rhanella aquatilis）+ TX、拉恩菌屬 + TX、根瘤菌（Dormal® + TX、Vault®）+ TX、絲核菌屬 + TX、球狀紅球菌菌株AQ719 + TX、雙倒卵形紅冬孢酵母菌（Rhodosporidium diobovatum）+ TX、圓紅冬孢酵母菌 + TX、紅酵母屬 + TX、黏紅酵母 + TX、禾本紅酵母 + TX、膠紅酵母（Rhodotorula mucilagnosa）+ TX、深紅酵母 + TX、釀酒酵母 + TX、玫瑰色鹽水球菌（Salinococcus roseus）+ TX、小核盤菌 + TX、小核盤菌（SARRITOR®）+ TX、柱頂孢黴屬 + TX、Scytalidium uredinicola + TX、甜菜夜蛾核型多角體病毒（Spod-X® + TX、Spexit®）+ TX、黏質沙雷氏菌 + TX、普城沙雷菌 + TX、沙雷氏菌屬 + TX、糞生糞殼菌 + TX、海灰翅夜蛾核型多角體病毒（Littovir®）+ TX、紅擲孢酵母 + TX、嗜麥芽寡養單胞菌 + TX、不吸水鏈黴菌 + TX、白丘鏈黴菌（Streptomyces albaduncus）+ TX、脫葉鏈黴菌 + TX、鮮黃鏈黴菌 + TX、灰平鏈黴菌 + TX、灰綠鏈黴菌（Mycostop®）+ TX、利迪鏈黴菌（Actinovate®）+ TX、利迪鏈黴菌WYEC-108（ActinoGrow®）+ TX、紫色鏈黴菌 + TX、小鐵艾酵母（Tilletiopsis minor）+ TX、鐵艾酵母屬 + TX、棘孢木黴（T34 Biocontrol®）+ TX、蓋姆斯木黴（Trichoderma gamsii）（Tenet®）+ TX、深綠木黴（Plantmate®）+ TX、鉤狀木黴TH 382 + TX、裡法哈茨木黴（Trichoderma harzianum rifai）（Mycostar®）+ TX、哈茨木黴T-22（Trianum-P® + TX、PlantShield HC® + TX、RootShield® + TX、Trianum-G®）+ TX、哈茨木黴T-39（Trichodex®）+ TX、非鉤木黴（Trichoderma inhamatum）+ TX、康寧木黴 + TX、木黴屬LC 52（Sentinel®）+ TX、木素木黴 + TX、長柄木黴 + TX、多孢木黴（Trichoderma polysporum）（Binab T®）+ TX、紫杉木黴 + TX、綠色木黴 + TX、綠色木黴（原來稱為綠色黏帚黴GL-21）（SoilGuard®）+ TX、綠色木黴 + TX、綠色木黴菌株ICC 080（Remedier®）+ TX、茁芽絲孢

酵母 + TX、毛孢子菌屬 + TX、單端孢屬 + TX、粉紅單端孢 + TX、Typhula phacorrhiza菌株94670 + TX、Typhula phacorrhiza菌株94671 + TX、黑細基格孢 + TX、奧德曼細基格孢（Ulocladium oudemansii）（Botry-Zen®）+ TX、玉蜀黍黑粉菌 + TX、各種細菌和補充營養素（Natural II®）+ TX、各種真菌（Millennium Microbes®）+ TX、厚垣輪枝孢菌 + TX、蠟蚧輪枝菌（Mycotal® + TX、Vertalec®）+ TX、Vip3Aa20（VIPtera®）+ TX、Virgibaclillus marismortui + TX、野油菜黃單胞菌（Xanthomonas campestris pv. Poae）（Camperico®）+ TX、伯氏致病桿菌 + TX、嗜線蟲致病桿菌；以及

【0331】 植物萃取物，包括：松油（Retenol®）+ TX、印楝素（Plasma Neem Oil® + TX、AzaGuard® + TX、MeemAzal® + TX、Molt-X® + TX、植物IGR（Neemazad® + TX、Neemix®）+ TX、菜籽油（Lilly Miller Vegol®）+ TX、土荊芥附近荊芥（Chenopodium ambrosioides near ambrosioides）（Requiem®）+ TX、菊花濃汁（Chrysanthemum extract）（Crisant®）+ TX、萃取印楝油（extract of neem oil）（Trilogy®）+ TX、唇形科的精油（Botania®）+ TX、丁香迷迭香薄荷的萃取物和百里香精油（Garden insect killer®）+ TX、甜菜鹼（Greenstim®）+ TX、大蒜 + TX、檸檬草精油（GreenMatch®）+ TX、印度楝樹精油 + TX、貓薄荷（薄荷精油）+ TX、荊芥卡塔琳娜州（Nepeta catarina）+ TX、 尼古丁 + Tx、牛至精油（MossBuster®）+ TX、胡麻科精油（Nematon®）+ TX、除蟲菊 + TX、皂皮樹（NemaQ®）+ TX、大虎杖（Reynoutria sachalinensis）（Regalia® + TX、Sakalia®）+ TX、魚藤酮（Eco Roten®）+ TX、藝香料植物萃取物（Soleo®）+ TX、豆油（Ortho ecosense®）+ TX、茶樹精油（Timorex Gold®）+ TX、百里香精油 + TX、AGNIQUE® MMF + TX、BugOil® + TX、迷迭香芝麻薄荷百里香和肉桂萃取物的混合物（EF 300®）+ TX、丁香迷迭香和薄荷萃取物的混合物（EF 400®）+ TX、丁香薄荷大蒜油和薄荷的混合物（Soil Shot®）+ TX、高嶺土

（Screen®）+ TX、儲存葡萄糖的褐藻（Laminarin®）；以及

【0332】 信息素，包括：黑頭螢火蟲信息素（3M噴灑型黑頭螢火蟲信息素®）+ TX、蘋果蠹蛾信息素（派拉蒙分配器（Paramount dispenser）-（CM）/Isomate C-Plus®）+ TX、葡萄卷葉蛾信息素（3M MEC-GBM噴灑型信息素®）+ TX、卷葉蟲信息素（3M MEC - LR噴灑型信息素®）+ TX、家蠅信息素（Snip7 Fly Bait® + TX、Starbar Premium Fly Bait®）+ TX、梨小食心蟲信息素（3M梨小食心蟲噴灑型信息素®）+ TX、桃樹鑽心蟲信息素（Isomate-P®）+ TX、番茄蟯蟲信息素（3M噴灑型信息素®）+ TX、Entostat粉（來自棕櫚樹的萃取物）（Exosex CM®）+ TX、（E + TX、Z + TX、Z）-3 + TX、8 + TX、11十四烷三烯基乙酸酯 + TX、（Z + TX、Z + TX、E）-7 + TX、11 + TX、13-十六碳三烯醛 + TX、（E + TX,Z）-7 + TX、9-十二碳二烯-1-基乙酸酯 + TX、2-甲基-1-丁醇 + TX、乙酸鈣 + TX、Scenturion® + TX、Biolure® + TX、Check-Mate® + TX、薰衣草千里酸酯（Lavandulyl senecioate）；以及

【0333】 宏生物劑（microbial），包括：短距蚜小蜂 + TX、阿爾蚜繭蜂（Aphidius ervi）（Aphelinus-System®）+ TX、Acerophagus papaya + TX、二星瓢蟲（Adalia-System®）+ TX、二星瓢蟲（Adaline®）+ TX、二星瓢蟲（Aphidalia®）+ TX、串繭跳小蜂（Ageniaspis citricola）+ TX、巢蛾多胚跳小蜂 + TX、安氏鈍綏螨（Amblyseius andersoni）（Anderline® + TX、Andersoni-System®）+ TX、加州鈍綏螨（Amblyseius californicus）（Amblyline® + TX、Spical®）+ TX、胡瓜鈍綏螨（Thripex® + TX、Bugline cucumeris®）+ TX、偽鈍綏螨（Fallacis®）+ TX、斯氏鈍綏螨（Bugline swirskii® + TX、Swirskii-Mite®）+ TX、奧氏鈍綏螨（WomerMite®）+ TX、粉虱細蜂（Amitus hesperidum）+ TX、原纓翅纓小蜂（Anagrus atomus）+ TX、暗腹長索跳小蜂（Anagyrus fusciventris）+ TX、卡瑪長索跳小蜂（Anagyrus kamali）+ TX、Anagyrus loecki + TX、粉蚧長索跳小蜂

（Anagyrus pseudococci）（Citripar®）+ TX、紅蠟蚧扁角跳小蜂（Anicetus benefices）+ TX、金小蜂（Anisopteromalus calandrae）+ TX、林地花蝽（Anthocoris nemoralis）（Anthocoris-System®）+ TX、短距蚜小蜂（Apheline® + TX、Aphiline®）+ TX、短翅蚜小蜂（Aphelinus asychis）+ TX、科列馬·阿布拉小蜂（Aphidius colemani）（Aphipar®）+ TX、阿爾蚜繭蜂（Ervipar®）+ TX、煙蚜繭蜂 + TX、桃赤蚜蚜繭蜂（Aphipar-M®）+ TX、食蚜癭蚊（Aphidend®）+ TX、食蚜癭蚊（Aphidoline®）+ TX、嶺南蚜小蜂 + TX、印巴黃金蚜小蜂 + TX、蠊卵長尾齧小蜂（Aprostocetus hagenowii）+ TX、隱翅蟲（Atheta coriaria）（Staphyline®）+ TX、熊蜂屬 + TX、歐洲熊蜂（Natupol Beehive®）+ TX、歐洲熊蜂（Beeline® + TX、Tripol®）+ TX、Cephalonomia stephanoderis + TX、黑背紅瓢蟲（Chilocorus nigritus）+ TX、普通草蛉（Chrysoperla carnea）（Chrysoline®）+ TX、普通草蛉（Chrysopa®）+ TX、紅通草蛉（Chrysoperla rufilabris）+ TX、Cirrospilus ingenuus + TX、Cirrospilus quadristriatus + TX、白星橘齧小蜂（Citrostichus phyllocnistoides）+ TX、Closterocerus chamaeleon + TX、Closterocerus屬 + TX、Coccidoxenoides perminutus（Planopar®）+ TX、Coccophagus cowperi + TX、賴食蚧蚜小蜂（Coccophagus lycimnia）+ TX、螟黃足盤絨繭蜂 + TX、菜蛾盤絨繭蜂 + TX、孟氏隱唇瓢蟲（Cryptobug® + TX、Cryptoline®）+ TX、日本方頭甲 + TX、西伯利亞離顎繭蜂 + TX、西伯利亞離顎繭蜂（Minusa®）+ TX、豌豆潛蠅姬小蜂（Diminex®）+ TX、小黑瓢蟲（Delphastus catalinae）（Delphastus®）+ TX、Delphastus pusillus + TX、Diachasmimorpha krausii + TX、長尾潛蠅繭蜂 + TX、Diaparsis jucunda + TX、阿裡食虱跳小蜂（Diaphorencyrtus aligarhensis）+ TX、豌豆潛葉蠅姬小蜂 + TX、豌豆潛葉蠅姬小蜂（Miglyphus® + TX、Digline®）+ TX、西伯利亞離顎繭蜂（DacDigline® + TX、Minex®）+ TX、歧脈跳小蜂屬 + TX、盾蚧長纓蚜小蜂 + TX、麗蚜小蜂（Encarsia max® + TX、Encarline® + TX、

En-Strip®）+ TX、漿角蚜小蜂（Eretmocerus eremicus）（Enermix®）+ TX、哥德恩蚜小蜂（Encarsia guadeloupae）+ TX、海地恩蚜小蜂（Encarsia haitiensis）+ TX、細餛飩蚜蠅（Syrphidend®）+ TX、Eretmoceris siphonini + TX、漿角蚜小蜂（Eretmocerus californicus）+ TX、漿角蚜小蜂（Eretmocerus eremicus）（Ercal® + TX、Eretline e®）+ TX、漿角蚜小蜂（Eretmocerus eremicus）（Bemimix®）+ TX、海氏槳角蚜小蜂 + TX、蒙氏槳角蚜小蜂（Bemipar® + TX、Eretline m®）+ TX、Eretmocerus siphonini + TX、四斑光緣瓢蟲（Exochomus quadripustulatus）+ TX、食蠣癭蚊（Feltiella acarisuga）（Spidend®）+ TX、食蠣癭蚊（Feltiline®）+ TX、阿里山潛蠅繭蜂 + TX、Fopius ceratitivorus + TX、芒柄花黃素（Wirless Beehome®）+ TX、細腰凶薊馬（Vespop®）+ TX、西方靜走蠣（Galendromus occidentalis）+ TX、萊氏棱角腫腿蜂（Goniozus legneri）+ TX、麥蛾柔繭蜂 + TX、異色瓢蟲（HarmoBeetle®）+ TX、異小桿線蟲屬（Lawn Patrol®）+ TX、嗜菌異小桿線蟲（NemaShield HB® + TX、Nemaseek® + TX、Terranem-Nam® + TX、Terranem® + TX、Larvanem® + TX、B-Green® + TX、NemAttack ® + TX、Nematop®）+ TX、大異小桿線蟲（Heterorhabditis megidis）（Nemasys H® + TX、BioNem H® + TX、Exhibitline hm® + TX、Larvanem-M®）+ TX、集棲瓢蟲（Hippodamia convergens）+ TX、尖狹下盾蠣（Hypoaspis aculeifer）（Aculeifer-System® + TX、Entomite-A®）+ TX、兵下盾蠣（Hypoaspis miles）（Hypoline m® + TX、Entomite-M®）+ TX、黑色枝跗癭蜂 + TX、Lecanoideus floccissimus + TX、Lemophagus errabundus + TX、三色麗突跳小蜂（Leptomastidea abnormis）+ TX、Leptomastix dactylopii（Leptopar®）+ TX、長角跳小蜂（Leptomastix epona）+ TX、Lindorus lophanthae + TX、Lipolexis oregmae + TX、叉葉綠蠅（Natufly®）+ TX、茶足柄瘤蚜繭蜂 + TX、暗黑長脊盲蝽（Macrolophus caliginosus）（Mirical-N® + TX、Macroline c® + TX、Mirical®）+ TX、Mesoseiulus

longipes + TX、黃色闊柄跳小蜂（Metaphycus flavus）+ TX、Metaphycus lounsburyi + TX、角紋脈褐蛉（Milacewing®）+ TX、黃色花翅跳小蜂（Microterys flavus）+ TX、Muscidifurax raptorellus和Spalangia cameroni（Biopar®）+ TX、Neodryinus typhlocybae + TX、加州新小綏螨 + TX、胡瓜鈍綏螨（THRYPEX®）+ TX、虛偽新小綏螨（Neoseiulus fallacis）+ TX、Nesideocoris tenuis（NesidioBug® + TX、Nesibug®）+ TX、古銅黑蠅（Biofly®）+ TX、狡小花蝽（Orius insidiosus）（Thripor-I® + TX、Oriline i®）+ TX、無毛小花蝽（Orius laevigatus）（Thripor-L® + TX、Oriline l®）+ TX、大型小花蝽（Orius majusculus）（Oriline m®）+ TX、小黑花椿象（Thripor-S®）+ TX、Pauesia juniperorum + TX、酸醬瓢蟲腹柄姬小蜂（Pediobius foveolatus）+ TX、Phasmarhabditis hermaphrodita（Nemaslug®）+ TX、Phymastichus coffea + TX、Phytoseiulus macropilus + TX、智利小植綏螨（Spidex® + TX、Phytoline p®）+ TX、斑腹刺益蝽（Podisus®）+ TX、Pseudacteon curvatus + TX、Pseudacteon obtusus + TX、Pseudacteon tricuspis + TX、Pseudaphycus maculipennis + TX、Pseudleptomastix mexicana + TX、具毛嗜木虱跳小蜂（Psyllaephagus pilosus）+ TX、同色短背繭蜂（Psyttalia concolor）（錯合物）+ TX、胯姬小蜂屬 + TX、Rhyzobius lophanthae + TX、澳洲瓢蟲 + TX、Rumina decollate + TX、Semielacher petiolatus + TX、麥長管蚜（Ervibank®）+ TX、小卷蛾斯氏線蟲（Nematac C® + TX、Millenium® + TX、BioNem C® + TX、NemAttack® + TX、 Nemastar® + TX、Capsanem®）+ TX、夜蛾斯氏線蟲（NemaShield® + TX、Nemasys F® + TX、BioNem F® + TX、Steinernema-System® + TX、NemAttack® + TX、Nemaplus® + TX、Exhibitline sf® + TX、Scia-rid® + TX、Entonem®）+ TX、鋸蜂線蟲（Steinernema kraussei）（Nemasys L® + TX、BioNem L® + TX、Exhibitline srb®）+ TX、裡奧布拉夫線蟲（Steinernema riobrave）（BioVector® + TX、BioVektor®）+ TX、螻蛄斯氏線

蟲(Steinernema scapterisci)(Nematac S®)+ TX、斯氏線蟲屬 + TX、Steinernematid 屬（Guardian Nematodes®）+ TX、深點食螨瓢蟲（Stethorus®）+ TX、亮腹釉小蜂 + TX、Tetrastichus setifer + TX、Thripobius semiluteus + TX、中華長尾小蜂（Torymus sinensis）+ TX、甘藍夜蛾赤眼蜂（Tricholine b®）+ TX、甘藍夜蛾赤眼蜂（Tricho-Strip®）+ TX、廣赤眼蜂 + TX、微小赤眼蜂 + TX、玉米螟赤眼蜂 + TX、寬脈赤眼蜂（Trichogramma platneri）+ TX、短管赤眼蜂 + TX、螟黑點瘤姬蜂；以及

【0334】 其他生物劑，包括：脫落酸 + TX、bioSea® + TX、銀葉菌（Chondrostereum purpureum）（Chontrol Paste®）+ TX、盤長孢狀刺盤孢（Collego®）+ TX、辛酸銅鹽（Cueva®）+ TX、δ陷阱（Delta trap）（Trapline d®）+ TX、解澱粉歐文氏菌（Harpin）（ProAct® + TX、Ni-HIBIT Gold CST®）+ TX、磷酸高鐵（Ferramol®）+ TX、漏斗陷阱（Trapline y®）+ TX、Gallex® + TX、Grower's Secret® + TX、高油菜素內酯 + TX、磷酸鐵（Lilly Miller Worry Free Ferramol Slug & Snail Bait®)+ TX、MCP冰雹陷阱(Trapline f®)+ TX、Microctonus hyperodae + TX、Mycoleptodiscus terrestris（Des-X®）+ TX、BioGain® + TX、Aminomite® + TX、Zenox® + TX、信息素陷阱（Thripline ams®）+ TX、碳酸氫鉀（MilStop®）+ TX、脂肪酸的鉀鹽（Sanova®）+ TX、矽酸鉀溶液（Sil-Matrix®）+ TX、碘化鉀 +硫氰酸鉀（Enzicur®）+ TX、SuffOil-X® + TX、蜘蛛毒 + TX、蝗蟲微孢子蟲（Semaspore Organic Grasshopper Control®）+ TX、黏著陷阱（Trapline YF® + TX、Rebell Amarillo®）+ TX以及陷阱（Takitrapline y + b®）+ TX；

【0335】 或選自以下的生物活性化合物或試劑：溴氟菊酯 + TX、氟螨嗪（Diflovidazine）+ TX、Flometoquin + TX、Fluhexafon + TX、小菜蛾顆粒體病毒 + TX、蘋果蠹蛾顆粒體病毒 + TX、新煙磷（Imicyafos）+ TX、煙芽夜蛾核

多角體病毒 + TX、Heliothis punctigera核多角體病毒 + TX、玉米穗夜蛾核多角體病毒 + TX、草地貪夜蛾核多角體病毒 + TX、小菜蛾核多角體病毒 + TX、對傘花烴 + TX、Pyflubumide + TX、Pyrafluprole + TX、QRD 420 + TX、QRD 452 + TX、QRD 460 + TX、萜類混合物 + TX、萜類 + TX、氟氰蟲醯胺(Tetraniliprole) + TX和α-萜品烯 + TX；

【0336】 或由如下代碼 + TX提及的活性物質：代碼AE 1887196（BSC-BX60309）+ TX、代碼NNI-0745 GR + TX、代碼IKI-3106 + TX、代碼JT-L001 + TX、代碼ZNQ-08056 + TX、代碼IPPA152201 + TX、代碼HNPC-A9908（CAS：[660411-21-2]）+ TX、代碼HNPC-A2005（CAS：[860028-12-2]）+ TX、代碼JS118 + TX、代碼ZJ0967 + TX、代碼ZJ2242 + TX、代碼JS7119（CAS：[929545-74-4]）+ TX、代碼SN-1172 + TX、代碼HNPC-A9835 + TX、代碼HNPC-A9955 + TX、代碼HNPC-A3061 + TX、代碼Chuanhua 89-1 + TX、代碼IPP-10 + TX、代碼ZJ3265 + TX、代碼JS9117 + TX、代碼ZJ3757 + TX、代碼ZJ4042 + TX、代碼ZJ4014 + TX、代碼ITM-121 + TX、代碼DPX-RAB55（DKI-2301）+ TX、代碼NA-89 + TX、代碼MIE-1209 + TX、代碼MCI-8007 + TX、代碼BCS-CL73507 + TX、代碼S-1871 + TX、代碼DPX-RDS63 + TX、Quinofumelin + TX、mefentrifluconazol + TX、fenpicoxamid + TX、fluindapyr + TX、inpyrfluxam + TX或indiflumetpyr + TX、isoflucypram + TX、pyrapropoyne + TX、florylpicoxamid + TX、metyltetraprole + TX、ipflufenoquin + TX、pyridachlometyl + TX或chlopyridiflu + TX、四氯蟲醯胺（tetrachlorantraniliprole）+ TX、tetrachloraniliprole + TX、Tyclopyrazoflor + TX、flupyrimin + TX或pyrifluramide + TX、benzpyrimoxan + TX、Benzosufyl + TX或oxazosulfyl + TX、乙唑螨腈（etpyrafen）+ TX、acynonapyr + TX或pyrinonafen + TX、側氧基三酮（oxotrione）+ TX、bixlozone + TX或clofendizone + TX或dicloroxizone + TX、cyclopyranil + TX

或pyrazocyclonil + TX或cyclopyrazonil + TX、α-溴敵隆 + TX和代碼AKD-1193 + TX。

【0337】 在活性成分之後的括弧中的參考例如*[3878-19-1]*係指化學文摘登記號。上文描述的混合配伍物係已知的。當活性成分包括在以下文獻中時："The Pesticide Manual" [The Pesticide Manual - A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C. D. S. TomLin; The British Crop Protection Council]["殺有害生物劑手冊"[殺有害生物劑手冊-一本世界手冊；第十三版；編者：C. D. S. TomLin；英國農作物保護委員會]]，它們在上文對於特定化合物在圓括號內給定的條目編號之下描述於該手冊中；例如，化合物"阿巴美丁"在條目編號 (1) 之下進行了描述。當上文對特定化合物加入" [CCN]"時，所討論的化合物包括在"Compendium of Pesticide Common Names [殺有害生物劑通用名綱要]"中，該綱要在互聯網上可得：[A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright © 1995-2004][A. Wood；殺有害生物劑通用名綱要，版權© 1995-2004]；例如，化合物"乙醯蟲腈"在互聯網地址http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html下進行了描述。

【0338】 上述活性成分中大部分在上文係藉由所謂的"通用名"、相關的"ISO通用名"或在個別情況下使用的另一個"通用名"來提及。若其名稱不是"通用名"，則所使用的名稱種類以特定化合物的圓括號中所給出的名稱來代替；在該情形下，使用IUPAC名、IUPAC/化學文摘名、"化學名稱"、"慣用名"、"化合物名稱"或"發展代碼"，或若既不使用那些名稱之一也不使用"通用名"，則使用"別名"。"CAS登記號"意指化學文摘登記號。

【0339】 選自表1至12和表P的具有式I之化合物與上文所述的活性成分的活性成分混合物包括選自表1至12和表P的化合物和如上文所述的活性成分，較佳的是處於從100：1至1：6000的混合比率，尤其是從50：1至1：50，更尤其是處

於從20：1至1：20的比率，甚至更尤其是從10：1至1：10，非常尤其是從5：1和1：5，特別較佳的是從2：1至1：2的比率，並且從4：1至2：1的比率同樣是較佳的，特別是處於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。那些混合比率係按重量計的。

【0340】 如上文所述的混合物可以被用於控制有害生物之方法中，該方法包括將含如上文所述的混合物的組成物施用於有害生物或其環境中，藉由手術或療法用於處理人或動物體的方法以及在人或動物體上實施的診斷方法除外。

【0341】 包含選自表1至12和表P的具有式I之化合物以及一種或多種如上文所述的活性成分的混合物可以例如以單一的“摻水即用”的形式施用，以組合的噴霧混合物（該混合物由該等單一活性成分的單獨配製物構成）（例如“桶混製劑”）施用，並且當以順序的方式（即，一種成分在另一種成分施用後適度短的時期之後施用，如幾小時或幾天），組合使用該等單一活性成分來施用。施用選自表1至12和表P的具有式I之化合物和如上文所述的活性成分的順序對於實施本發明並不是至關重要的。

【0342】 根據本發明的組成物還可以包含其他固體或液體助劑，如穩定劑，例如未環氧化的或環氧化的植物油（例如環氧化的椰子油、菜籽油或大豆油），消泡劑（例如矽油），防腐劑，黏度調節劑，黏合劑和/或增黏劑，肥料或其他用於獲得特定效果的活性成分，例如殺細菌劑、殺真菌劑、殺線蟲劑、植物活化劑、殺軟體動物劑或除草劑。

【0343】 根據本發明的組成物係以本身已知的方式，在不存在助劑的情況

下，例如藉由研磨、篩選和/或壓縮固體活性成分；和在至少一種助劑的存在下，例如藉由緊密混合活性成分與一種或多種助劑和/或將活性成分與一種或多種助劑一起研磨來製備。用於製備組成物的該等方法和用於製備該等組成物的化合物 (I) 之用途也是本發明的主題。

【0344】 該等組成物的施用方法，即控制上述類型的有害生物的方法，如噴霧、霧化、撒粉、刷塗、包衣、撒播或澆灌 - 它們被選擇以適於普遍情況的預期目的 - 以及該等組成物用於控制上述類型的有害生物的用途係本發明的其他主題。典型的濃度比係在0.1與1000 ppm之間，較佳的是在0.1與500 ppm之間的活性成分。每公項的施用率通常是每公項1 g至2000 g活性成分，尤其是10 g/ha至1000 g/ha，較佳的是10 g/ha至600 g/ha。

【0345】 在作物保護領域中，較佳的施用方法係施用至該等植物的葉（葉施藥），可能的是選擇施用的頻率和比率以符合所提及的有害生物的侵染風險。可替代地，活性成分可以藉由根系統（內吸作用）到達植物，這係藉由用液體組成物將該等植物的場所浸透或者藉由將固體形式的活性成分摻入植物的場所（例如摻入土壤，例如以顆粒的形式（土施））來實現的。在水稻作物的情況下，此類顆粒劑可以被計量地添加到淹水的稻田中。

【0346】 本發明的化合物及其組成物還適合於保護植物繁殖材料(例如種子，如果實、塊莖或籽粒，或者苗圃植物）對抗上述類型的有害生物。可以用化合物在種植前對繁殖材料進行處理，例如可以在播種前對種子進行處理。可替代地，化合物可以施用至種子籽粒（包衣），這係藉由將籽粒浸漬入液體組成物中或藉由施塗固體組成物層來實現的。當繁殖材料被種植在施用處時，還可能的是例如在條播期間將組成物施入種子犁溝。該等用於植物繁殖材料的處理方法和如此處理的植物繁殖材料係本發明另外的主題。典型的處理比率將取決於待控制的植物和有害生物/真菌，並且通常在每100 kg種子1克至200克之

間，較佳的是在每100 kg種子5克至150克之間，如在每100 kg種子10克至100克之間。

【0347】 術語種子包括所有種類的種子以及植物繁殖體，包括但並不限於真正的種子、種子塊、吸盤、穀粒、鱗莖、果實、塊莖、穀物、根莖、插條、切割枝條等並且在較佳的實施方式中是指真正的種子。

【0348】 本發明還包括用具有式I之化合物包衣或處理的種子或含有具有式I之化合物的種子。儘管成分的較多或較少的部分可以滲透到該種子材料中，這取決於施用的方法，術語“包衣或處理和/或含有”通常表示在施用的時候，在大多數情況下，該活性成分在該種子的表面。當所述種子產品被（再）種植時，它可以吸收活性成分。在一個實施方式中，本發明使得其上黏附有具有式 (I) 之化合物的植物繁殖材料可得。此外，由此可得包含用具有式 (I) 之化合物處理過的植物繁殖材料的組成物。

【0349】 種子處理包括本領域已知的所有適合的種子處理技術，如拌種、種子包衣、種子撒粉、浸種以及種子造粒。可以藉由任何已知的方法實現具有式 (I) 之化合物的種子處理施用，如在種子播種之前或播種/種植過程中噴霧或藉由撒粉。

生物學實施例：

【0350】 接下來的實施例用來闡述本發明。本發明的某些化合物與已知的化合物的區別可以在於在低施用率下更大的療效，這可以由熟習該項技術者使用在實施例中概述的實驗程序，使用更低的施用率（如果必要的話）例如，50 ppm、25 ppm、12.5 ppm、6 ppm、3 ppm、1.5 ppm、0.8 ppm、0.2 ppm或0.05 ppm來證實。

實施例B1：對抗海灰翅夜蛾（*Spodoptera littoralis*）（埃及棉葉蟲）的活性

【0351】 將棉花葉圓片置於24孔微量滴定板中的瓊脂上並且用從10'000 ppm DMSO儲備溶液中製備的水性測試溶液進行噴霧。在乾燥之後，將葉圓片用五隻L1期幼蟲進行侵染。侵染3天之後，相比於未處理樣品，針對死亡率、拒食效果以及生長抑制對該等樣品進行評估。當類別（死亡率、拒食效果以及生長抑制）中至少一個高於未處理樣品時，測試樣品對海灰翅夜蛾給出了控制。

【0352】 以下化合物在200 ppm施用率下得到至少80%的控制：P3、P5、P6、P19、P22、P25、P26、P29、P35、P38、P39、P45。

實施例B2：對抗海灰翅夜蛾（埃及棉葉蟲）的活性

【0353】 將測試化合物用移液管從10'000 ppm DMSO儲備溶液施用到24孔板中並且與瓊脂進行混合。將萵苣種子置於瓊脂上並且用另一塊也含有瓊脂的平板封閉該多孔板。7天之後，根吸收了化合物並且萵苣生長進入了蓋平板。然後，將萵苣葉切到蓋平板中。將夜蛾屬卵吸移穿過潮濕凝膠印記紙上的塑膠範本及其所封閉的蓋平板。侵染6天之後，相比於未處理樣品，針對死亡率、拒食效果以及生長抑制對該等樣品進行評估。

【0354】 以下化合物在12.5 ppm測試比率下給出了三個類別（死亡率、拒食效果或生長抑制）中至少一個的至少80%的效果：P3和P5。

實施例B3：對抗小菜蛾（*Plutella xylostella*）（小菜蛾（Diamond back moth））的活性

【0355】 將具有人工飼料的24孔微量滴定板用從10'000 ppm DMSO儲備溶液中製備的水性測試溶液藉由移液進行處理。在乾燥之後，用L2期幼蟲對各板進行侵染（10至15隻/孔）。侵染5天之後，相比於未處理樣品，針對死亡率和

生長抑制對該等樣品進行評估。

【0356】 以下化合物在200 ppm施用率下給出了兩個類別（死亡率或生長抑制）中至少一個的至少80%的效果：P3、P4、P5、P6、P7、P8、P18、P21、P22。

實施例B4：對抗黃瓜條葉甲（*Diabrotica balteata*）（玉米根蟲）的活性

【0357】 將24孔微量滴定板中的置於瓊脂層上的玉米芽用藉由噴霧用從10'000 ppm DMSO儲備溶液中製備的水性測試溶液進行處理。在乾燥之後，用L2期幼蟲對各板進行侵染（6至10隻/孔）。侵染4天之後，相比於未處理樣品，針對死亡率和生長抑制對該等樣品進行評估。

【0358】 以下化合物在200 ppm施用率下給出了兩個類別（死亡率或生長抑制）中至少一個的至少80%的效果：P3、P4、P5、P6、P7、P18、P19、P22、P23、P24、P25、P26、P29、P35、P36、P45。

實施例B5：對抗桃蚜（青桃蚜）的活性

【0359】 將向日葵葉圓片置於24孔微量滴定板中的瓊脂上並且用從10'000 ppm DMSO儲備溶液中製備的水性測試溶液進行噴霧。在乾燥之後，將葉圓片用混合年齡的蚜蟲群體進行侵染。侵染6天之後，針對死亡率對該等樣品進行評估。

【0360】 以下化合物在200 ppm施用率下得到至少80%的死亡率：P3、P4、P5、P6、P8、P9、P11、P13、P14、P16、P17、P18、P19、P20、P21、P22、P23、P36、P37。

實施例B6：對抗桃蚜（青桃蚜）的活性

【0361】 將受到混合年齡的蚜蟲群體侵染的豌豆幼苗的根部直接放在從10'000 ppm DMSO儲備溶液中製備的水性測試溶液中。將幼苗放置在測試溶液中6天之後，針對死亡率對該等樣品進行評估。

【0362】 以下化合物在24 ppm測試比率下得到至少80%的死亡率：P3、P4、P5、P6、P8、P9、P11、P13、P14、P16、P17、P18、P19、P21、P22、P23、P36。

實施例B7：對抗煙粉虱（*Bemisia tabaci*）（棉粉虱）的活性

【0363】 將棉花葉圓片置於24孔微量滴定板中的瓊脂上並且用從10'000 ppm DMSO儲備溶液中製備的水性測試溶液進行噴霧。在乾燥之後，將葉圓片用成年粉虱進行侵染。培養6天之後，針對死亡率對該等樣品進行檢查。

【0364】 以下化合物在200 ppm施用率下得到至少80%的死亡率：P3、P5、P6、P8、P22、P36。

實施例B8：對抗西花薊馬（*Frankliniella occidentalis*）（西方花薊馬（Western flower thrips））的活性

【0365】 將向日葵葉圓片置於24孔微量滴定板中的瓊脂上並且用從10'000 ppm DMSO儲備溶液中製備的水性測試溶液進行噴霧。在乾燥之後，將葉圓片用混合年齡的花薊馬種群進行侵染。侵染7天之後，針對死亡率對該等樣品進行評估。

【0366】 以下化合物在200 ppm施用率下得到至少80%的死亡率：P3、P4、P5、P8、P9、P14、P16、P21、P22。

實施例B9：對抗大豆褐椿（*Euschistus heros*）（新熱帶褐臭蝽（Neotropical Brown

Stink Bug））的活性

【0367】 將24孔微量滴定板中的瓊脂上的大豆葉用從10'000 ppm DMSO儲備溶液中製備的水性測試溶液進行噴霧。在乾燥之後，用N2期若蟲對葉片進行侵染。侵染5天之後，相比於未處理樣品，針對死亡率和生長抑制對該等樣品進行評估。

【0368】 以下化合物在200 ppm施用率下給出了兩個類別（死亡率或生長抑制）中至少一個的至少80%的效果：P3、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P14、P16、P17、P18、P19、P21、P22、P25、P29、P36、P37、P39、P42、P43、P44、P45。

實施例B10：對抗二點葉螨（二斑葉螨）的活性

【0369】 將24孔微量滴定板中的瓊脂上的豆葉圓片用從10'000 ppm DMSO儲備溶液中製備的水性測試溶液進行噴霧。在乾燥之後，將葉圓片用混合年齡的螨種群進行侵染。侵染8天之後，針對混合種群（流動平台）的死亡率對該等樣品進行評估。

【0370】 以下化合物在200 ppm施用率下得到至少80%的死亡率：P6。

實施例B11：對抗埃及斑蚊（黃熱病蚊子）的活性

【0371】 在乙醇中，以200 ppm的施用率，將測試溶液施用到12孔組織培養板中。一旦沈積物乾燥，將五天、兩天至五天大的成年雌性埃及斑蚊添加到每個孔中，並且在棉塞中保持10%的蔗糖溶液。引入後一小時，進行擊倒評估，並且在引入後24小時和48小時，評估死亡率。

【0372】 以下化合物在48 h和/或24 h後對埃及斑蚊給出至少80%的控制：P3。

實施例B12：對抗小菜蛾（*Plutella xylostella*）（小菜蛾（Diamond back moth））的活性

【0373】 將具有人工飼料的24孔微量滴定板用從10’000 ppm DMSO儲備溶液中製備的水性測試溶液藉由移液進行處理。在乾燥後，將小菜蛾卵吸移穿過凝膠印記紙上的塑膠範本及其所封閉的平板。侵染8天之後，相比於未處理樣品，針對死亡率和生長抑制對該等樣品進行評估。以下化合物在200 ppm施用率下給出了兩個類別（死亡率或生長抑制）中至少一個的至少80%的效果：P25、P26、P29、P35、P36、P37、P38、P39、P40、P42、P43、P44、P45。

【符號說明】

無

201920146

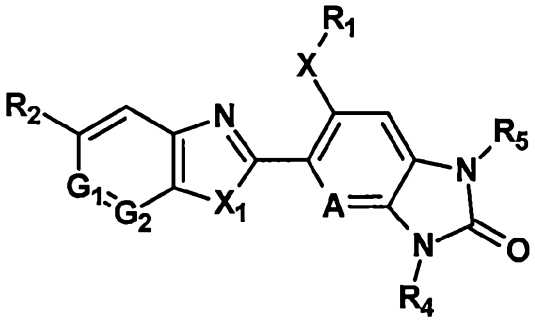
【發明摘要】

【中文發明名稱】 具有含硫取代基之殺有害生物活性雜環衍生物

【英文發明名稱】 Pesticidally active heterocyclic derivatives with sulfur containing substituents

【中文】

具有式I之化合物

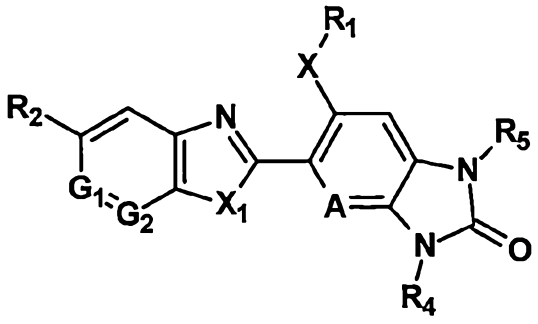


(I)，

其中R_2、G_1、G_2、X、X_1、A、R_4和R_5係如在申請專利範圍第1項中所定義的，以及那些化合物的農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物和N-氧化物，可以用作殺昆蟲劑並且可按照本身已知的方式製備。

【英文】

Compounds of formula I



(I),

wherein the substituents are as defined in claim 1, and the agrochemically acceptable salts, stereoisomers, enantiomers, tautomers and N-oxides of those compounds, can be used as insecticides and can be prepared in a manner known per se.

【指定代表圖】　　無

【代表圖之符號簡單說明】

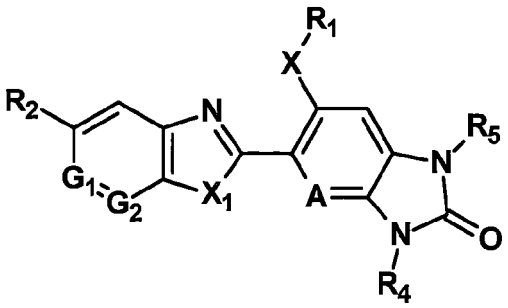
無

【特徵化學式】

無

【發明申請專利範圍】

【第1項】一種具有式I之化合物，



(I)，

其中

A表示CH或N；

X係S、SO或SO_2；

X_1係O、S或NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基；

R_1係C_1-C_4烷基、C_1-C_4鹵代烷基或C_3-C_6環烷基C_1-C_4烷基；

R_2係鹵素、C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基、C_1-C_4鹵代烷基磺醯基或C_1-C_6鹵代烷氧基；

G_1係N或CH；

G_2係N或CH；並且

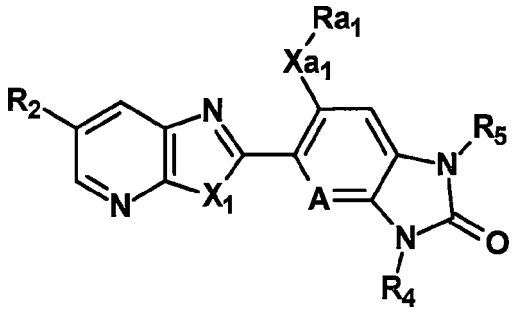
R_4和R_5彼此獨立地是氫、C_1-C_6烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6炔基、C_3-C_6環烷基C_1-C_4烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6鹵代烯基、C_3-C_6鹵代環烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_6鹵代烷氧基、C_1-C_4烷基磺醯基、C_3-C_6環烷基磺醯基、C_1-C_4烷基羰基、C_3-C_6環烷基羰基、C_1-C_4烷氧基羰基或氰基；以及

具有式I之化合物的農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物和N-氧化物。

【第2項】如申請專利範圍第1項所述之具有式I之化合物，其中R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6炔基、C_3-C_6環烷基C_1-C_4烷基、C_3-C_6環烷

基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6鹵代烯基、C_3-C_6鹵代環烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_6鹵代烷氧基、C_1-C_4烷基磺醯基、C_3-C_6環烷基磺醯基、C_1-C_4烷基羰基、C_3-C_6環烷基羰基、C_1-C_4烷氧基羰基或氰基。

【第3項】如申請專利範圍第1項所述之具有式I之化合物，由具有式I-1之化合物表示



(I-1)，

其中R_2、X_1、A、R_4和R_5係如在申請專利範圍第1項中所定義的；

Xa_1係S、SO或SO_2；並且

Ra_1係甲基、乙基、正丙基、異丙基或環丙基甲基。

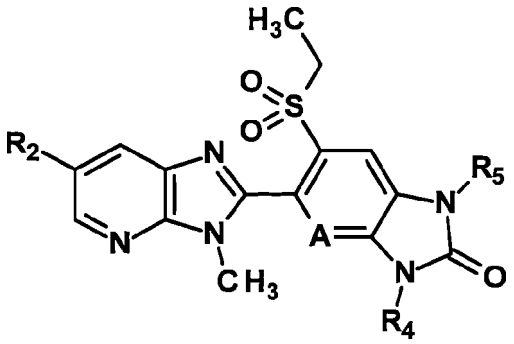
【第4項】如申請專利範圍第3項所述之具有式I-1之化合物，其中R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6炔基、C_3-C_6環烷基C_1-C_4烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6鹵代烯基、C_3-C_6鹵代環烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_6鹵代烷氧基、C_1-C_4烷基磺醯基、C_3-C_6環烷基磺醯基、C_1-C_4烷基羰基、C_3-C_6環烷基羰基、C_1-C_4烷氧基羰基或氰基。

【第5項】如申請專利範圍第3項所述之具有式I-1之化合物，其中X_1係NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基；並且R_2係C_1-C_6鹵代烷基。

【第6項】如申請專利範圍第3、4或5項所述之具有式I-1之化合物，其中R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基，較佳的是甲基或乙基。

【第7項】如申請專利範圍第1項所述之具有式I之化合物，由具有式I-2之化

合物表示



(I-2)，

其中

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【第8項】如申請專利範圍第7項所述之具有式I-2之化合物，

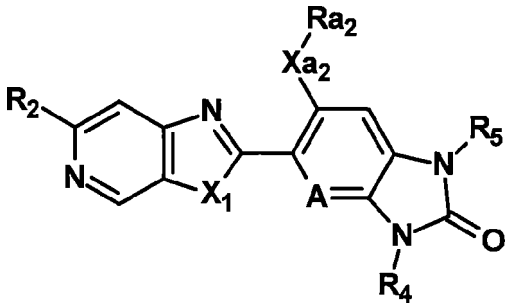
其中

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基，較佳的是甲基或乙基。

【第9項】如申請專利範圍第1項所述之具有式I之化合物，由具有式I-3之化合物表示



(I-3)，

其中R_2、X_1、A、R_4和R_5係如在申請專利範圍第1項中所定義的；

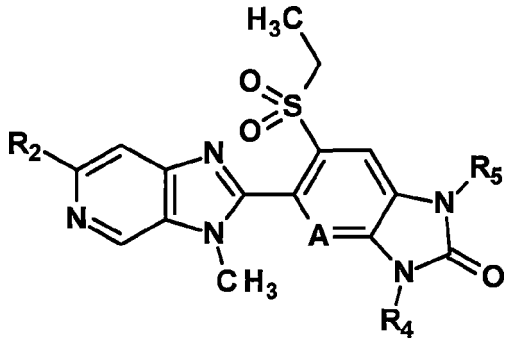
Xa_2係S、SO或SO_2；並且

Ra_2係甲基、乙基、正丙基、異丙基或環丙基甲基。

【第10項】如申請專利範圍第9項所述之具有式I-3之化合物，其中R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6炔基、C_3-C_6環烷基C_1-C_4烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6鹵代烯基、C_3-C_6鹵代環烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_6鹵代烷氧基、C_1-C_4烷基磺醯基、C_3-C_6環烷基磺醯基、C_1-C_4烷基羰基、C_3-C_6環烷基羰基、C_1-C_4烷氧基羰基或氰基。

【第11項】如申請專利範圍第10項所述之具有式I-3之化合物，其中R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【第12項】如申請專利範圍第1項所述之具有式I之化合物，由具有式I-4之化合物表示



(I-4)，

其中

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【第13項】如申請專利範圍第12項所述之具有式I-4之化合物，

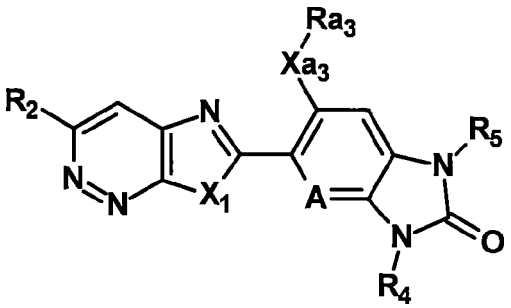
其中

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基。

【第14項】如申請專利範圍第1項所述之具有式I之化合物，由具有式I-5之化合物表示



(I-5)，

其中R_2、X_1、A、R_4和R_5係如在申請專利範圍第1項中所定義的；

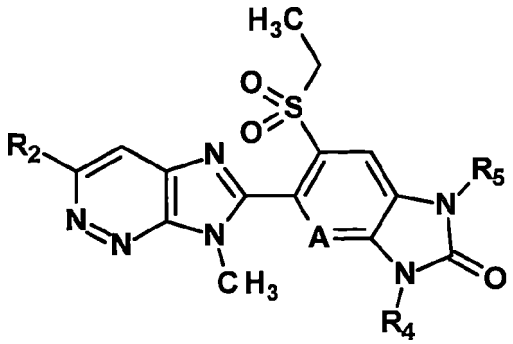
Xa_3係S、SO或SO_2；並且

Ra_3係甲基、乙基、正丙基、異丙基或環丙基甲基。

【第15項】如申請專利範圍第14項所述之具有式I-5之化合物，其中R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6炔基、C_3-C_6環烷基C_1-C_4烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6鹵代烯基、C_3-C_6鹵代環烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_6鹵代烷氧基、C_1-C_4烷基磺醯基、C_3-C_6環烷基磺醯基、C_1-C_4烷基羰基、C_3-C_6環烷基羰基、C_1-C_4烷氧基羰基或氰基。

【第16項】如申請專利範圍第15項所述之具有式I-5之化合物，其中R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基；較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【第17項】如申請專利範圍第1項所述之具有式I之化合物，由具有式I-6之化合物表示



(I-6)，

其中

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【第18項】如申請專利範圍第17項所述之具有式I-6之化合物，

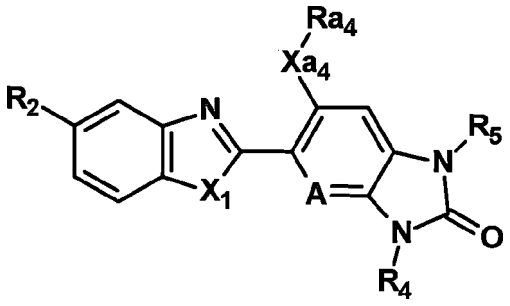
其中

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基，較佳的是甲基或乙基。

【第19項】如申請專利範圍第1項所述之具有式I之化合物，由具有式I-7之化合物表示



(I-7)，

其中R_2、X_1和A係如上文在式I下所定義的；並且其中

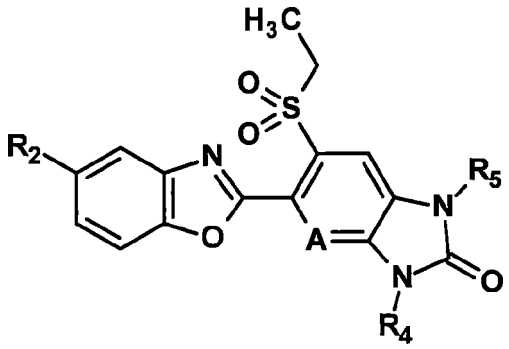
Xa_4係S、SO或SO_2；

Ra_4係甲基、乙基、正丙基、異丙基或環丙基甲基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6烯基、C_3-C_6炔基、C_3-C_6環烷基C_1-C_4烷基、C_3-C_6環烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6鹵代烯基、C_3-C_6鹵代環烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_6鹵代烷氧基、C_1-C_4烷基磺醯基、C_3-C_6環烷基磺醯基、C_1-C_4烷基羰基、C_3-C_6環烷基羰基、C_1-C_4烷氧基羰基或氰基。

【第20項】如申請專利範圍第19項所述之具有式I-7之化合物，其中R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【第21項】如申請專利範圍第1項所述之具有式I之化合物，由具有式I-8之化合物表示



(I-8)，

其中

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【第22項】如申請專利範圍第21項所述之具有式I-8之化合物，

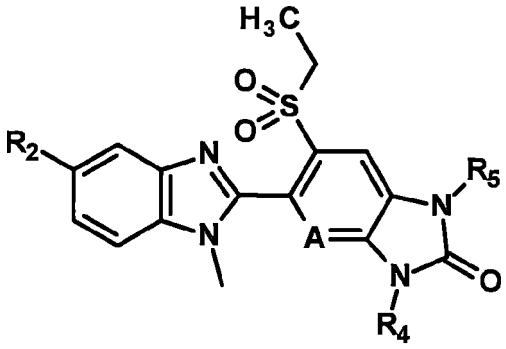
其中

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基，較佳的是甲基或乙基。

【第23項】如申請專利範圍第1項所述之具有式I之化合物，由具有式I-8a之化合物表示



(I-8a)，

其中

A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；

R_5係C_1-C_6烷基，較佳的是甲基或乙基；並且

R_4係C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基。

【第24項】如申請專利範圍第23項所述之具有式I-8a之化合物，

其中

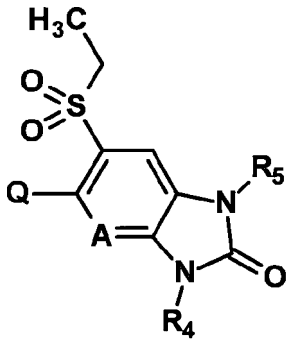
A係CH或N；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基，較佳的是甲基或乙基。

【第25項】如申請專利範圍第1項所述之具有式I之化合物，由具有式I-9之

化合物表示



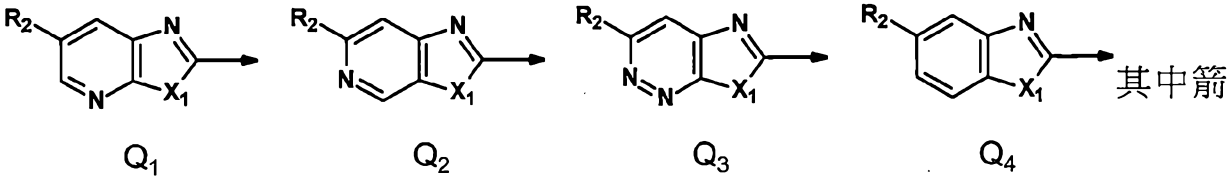
(I-9)，

其中

A係CH或N；

R_4和R_5彼此獨立地是氫或C_1-C_6烷基，較佳的是甲基或乙基；並且

Q係選自下組的基團，該組由下式組成：Q_1、Q_2、Q_3和Q_4



Q_1 Q_2 Q_3 Q_4

其中箭頭表示與摻入了基團A的雙環的附接點；

並且其中

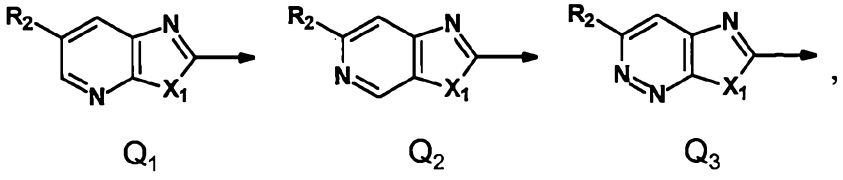
R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；特別地是C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基；並且

X_1係O或NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基。

【第26項】如申請專利範圍第25項所述之具有式I-9之化合物，

其中

Q選自下組，該組由下式組成：Q_1、Q_2和Q_3；



Q_1 Q_2 Q_3

其中箭頭表示與摻入了基團A的雙環的附接點；

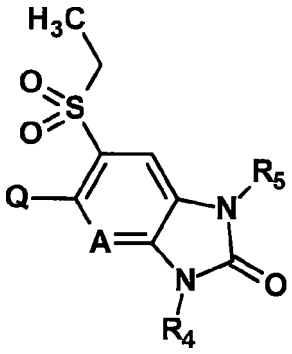
並且其中

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基或三氟甲基磺醯基；特別地，R_2係C_1-C_6鹵代烷基，較佳的是三氟甲基；並且

X_1係O或NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基，較佳的是甲基；特別地，X_1係NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基，更較佳的是甲基。

【第27項】如申請專利範圍第25或26項所述之具有式I-9之化合物，其中X_1係NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基，較佳的是甲基。

【第28項】如申請專利範圍第1項所述之具有式I之化合物，由具有式I-10之化合物表示



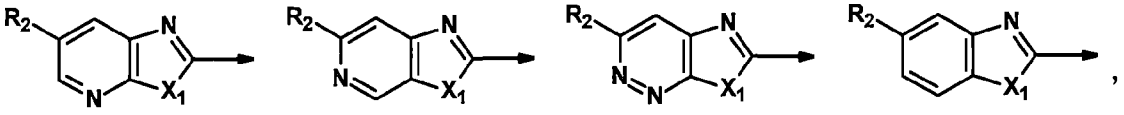
(I-10)，

其中

A係CH或N；

R_4和R_5彼此獨立地是C_1-C_6烷基、C_3-C_6環烷基磺醯基、氰基、C_1-C_4烷基磺醯基C_1-C_4烷基、C_1-C_4烷基氫硫基C_1-C_4烷基、C_1-C_6烷氧基C_1-C_6烷基、C_1-C_6鹵代烷基、C_3-C_6環烷基羰基或C_1-C_4烷氧基羰基，甚至更較佳的是甲基、乙基、環丙基磺醯基、氰基、甲基磺醯基甲基、甲基氫硫基甲基、甲氧基甲基、2,2,2-三氟乙基、環丙基羰基或乙氧基羰基；並且

Q係選自下組的基團，該組由下式組成：Q_1、Q_2、Q_3和Q_4



Q_1 Q_2 Q_3 Q_4

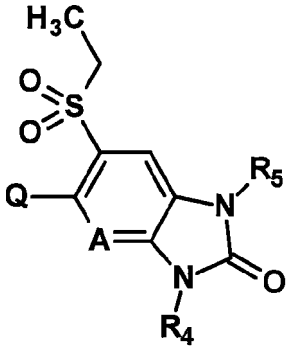
其中箭頭表示與摻入了基團A的雙環的附接點；

並且其中

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

X_1係O或NR_3，其中R_3係C_1-C_4烷基，較佳的是甲基。

【第29項】如申請專利範圍第1項所述之具有式I之化合物，由具有式I-11之化合物表示



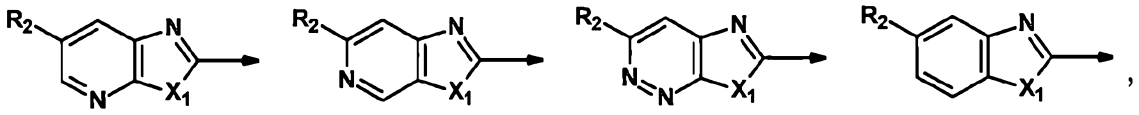
(I-11)，

其中

A係CH或N；

R_4和R_5係甲基；並且

Q係選自下組的基團，該組由下式組成：Q_1、Q_2、Q_3和Q_4



Q_1 Q_2 Q_3 Q_4

其中箭頭表示與摻入了基團A的雙環的附接點；

並且其中

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基、C_1-C_4鹵代烷基亞磺醯基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基、三氟甲基亞磺醯基或三氟甲基磺醯基；並且

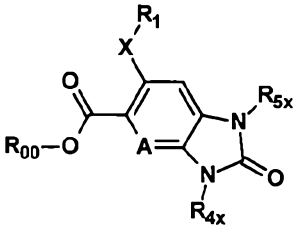
X_1係O或NCH_3。

【第30項】一種殺有害生物組成物，包含殺昆蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物有效量的如申請專利範圍第1-29項中任一項所定義的具有式 (I) 之化合物、或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，在每種情況下處於游離形式或處於農用化學上可使用的鹽形式；以及視需要至少一種助劑或稀釋劑。

【第31項】一種對抗並控制昆蟲、蟎、線蟲或軟體動物之方法，該方法包括向有害生物、有害生物的場所或易受有害生物攻擊的植物施用殺昆蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物有效量的如申請專利範圍第1-29項中任一項所定義的具有式 (I) 之化合物、或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物，或如申請專利範圍30所定義的組成物。

【第32項】一種用於保護植物繁殖材料免受昆蟲、蟎、線蟲或軟體動物攻擊之方法，該方法包括用如申請專利範圍第30項所述之組成物處理該繁殖材料或該繁殖材料所種植之場所。

【第33項】一種具有式XIVx之化合物，



(XIVx)，

其中

A係CH或N；

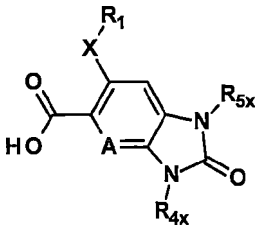
X係S、SO或SO_2，較佳的是S或SO_2；

R_1係C_1-C_4烷基，較佳的是乙基；

R_{00}係C_1-C_4烷基，較佳的是甲基、乙基或三級丁基；並且

R_{4x}和R_{5x}彼此獨立地是氫或C_1-C_6烷基，較佳的是氫、甲基或乙基。

【第34項】一種具有式XIIIx之化合物，



(XIIIx)，

其中

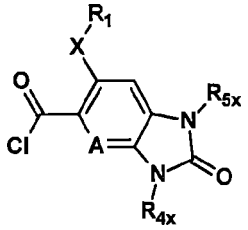
A係CH或N；

X係S、SO或SO_2，較佳的是S或SO_2；

R_1係C_1-C_4烷基，較佳的是乙基；並且

R_{4x}和R_{5x}彼此獨立地是氫或C_1-C_6烷基，較佳的是氫、甲基或乙基。

【第35項】一種具有式XIIx之化合物，



(XIIx)，

其中

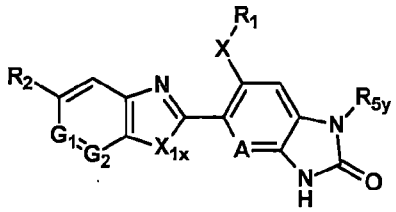
A係CH或N；

X係S、SO或SO_2，較佳的是S或SO_2；

R_1係C_1-C_4烷基，較佳的是乙基；並且

R_{4x}和R_{5x}彼此獨立地是氫或C_1-C_6烷基，較佳的是氫、甲基或乙基。

【第36項】一種具有式II-ab之化合物，



(II-ab)，

其中

A係CH或N，較佳的是CH；

X係S、SO或SO_2，較佳的是S或SO_2；

R_1係C_1-C_4烷基，較佳的是乙基；

X_{1X}係O或NCH_3；

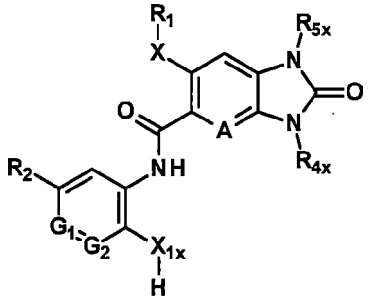
R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基或三氟甲基磺醯基；

G_1係N或CH；

G_2係N或CH；並且

R_{5y}係C_1-C_6烷基，較佳的是甲基或乙基。

【第37項】一種具有式XIx之化合物，



(XIx)，

或其區域異構物（regioisomer）、或其異構物混合物（以任何比例）；

其中

A係CH或N，較佳的是CH；

X係S、SO或SO_2，較佳的是S或SO_2；

R_1係C_1-C_4烷基，較佳的是乙基；

X_{1X}係O或NCH_3；

R_2係C_1-C_6鹵代烷基、C_1-C_4鹵代烷基氫硫基或C_1-C_4鹵代烷基磺醯基，較佳的是三氟甲基、三氟甲基氫硫基或三氟甲基磺醯基；

G_1係N或CH；

G_2係N或CH；並且

R_{4x}和R_{5x}彼此獨立地是氫或C_1-C_6烷基，較佳的是氫、甲基或乙基、氫或甲基。