



(12)发明专利



(10)授权公告号 CN 107207466 B

(45)授权公告日 2020.09.08

(21)申请号 201580075219.0

(22)申请日 2015.12.01

(65)同一申请的已公布的文献号

申请公布号 CN 107207466 A

(43)申请公布日 2017.09.26

(30)优先权数据

14195937.9 2014.12.02 EP

(85)PCT国际申请进入国家阶段日

2017.08.01

(86)PCT国际申请的申请数据

PCT/EP2015/078164 2015.12.01

(87)PCT国际申请的公布数据

W02016/087421 DE 2016.06.09

(73)专利权人 拜耳作物科学股份公司

地址 德国莱茵河畔蒙海姆

(72)发明人 P·耶施克 A·阿尔特

S·瑟斯佐-高尔维兹 A·沃斯特

M·菲斯莱恩 R·费舍尔

T·布雷特施奈德 K·伊尔格

O·马萨姆 P·洛塞尔

(74)专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司 11285

代理人 侯婧 钟守期

(51)Int.Cl.

C07D 401/14(2006.01)

C07D 401/04(2006.01)

A01N 43/56(2006.01)

A01P 7/04(2006.01)

(56)对比文件

W0 2015038503 A1,2015.03.19

W0 2014126580 A1,2014.08.21

CN 103119036 A,2013.05.22

审查员 熊潇瑜

权利要求书4页 说明书196页

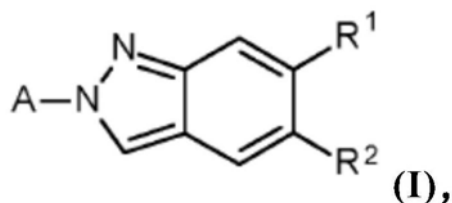
(54)发明名称

作为害虫防治剂的双环化合物

(57)摘要

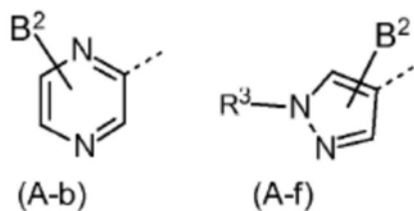
本发明涉及新的双环化合物、包含所述化合物的试剂、其用于防治动物害虫的用途以及用于其制备的方法和中间体产物。

1. 式 (I) 的化合物



其中

A代表选自 (A-b) 和 (A-f) 的A基团

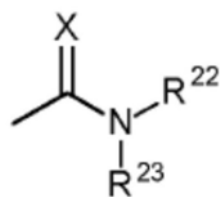


其中虚线代表与式 (I) 的双环的氮原子连接的键,

B²代表氢,

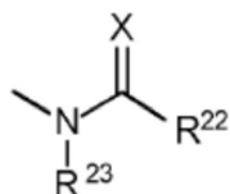
R¹代表氢,

R² c) 代表下式的基团



或者

R² d) 代表下式的基团



X代表氧,

R³代表C₁-C₄-烷基,

R²²如果R²代表基团c), 则R²²代表选自如下的基团: C₁-C₆-烷基、任选地被氰基取代的C₃-C₆环烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-烷基硫基-C₁-C₄-烷基、二-(C₁-C₄-烷基)-氨基磺酰基,

R²³如果R²代表基团c), 则R²³代表选自氢和C₁-C₆-烷基的基团,

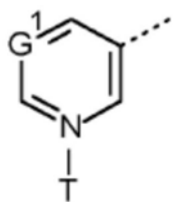
R²²如果R²代表基团d), 则R²²代表选自如下的基团: C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷基硫基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基-C₁-C₄-烷基和C₁-C₄-烷基磺酰基-C₁-C₄-烷基,

R²³如果R²代表基团d), 则R²³代表选自氢和C₁-C₆-烷基的基团, 且

在R²=d) 的情况下

R²²还代表任选地被卤素、C₁-C₆-烷基-和C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基取代的苯基, 以及

式 (I) 的化合物, 其中
A 代表 A 基团



(A-a)

其中虚线代表与式 (I) 的双环的氮原子连接的键,

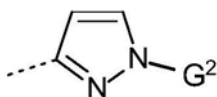
G¹ 代表 N 或 C-B¹,

B¹ 代表选自氢和氟的基团,

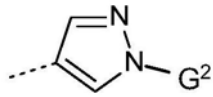
T 代表电子对,

R¹ 代表氢,

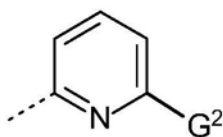
R² aa) 代表选自如下的基团



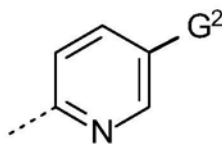
(B-3)



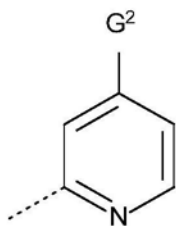
(B-4)



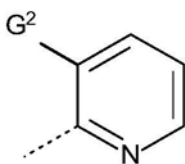
(B-21)



(B-22)



(B-35)



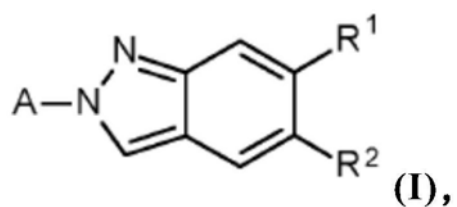
(B-36)

其中

G² 代表选自如下的基团: 卤素、C₁-C₄-烷基硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-烷基硫基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基磺酰基-C₁-C₄-烷基, 或者

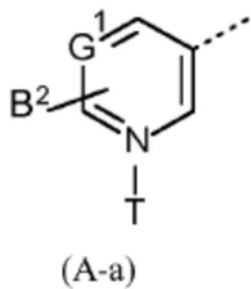
R² f) 代表卤代烷基。

2. 式 (I) 的化合物



其中

A代表A基团 (A-a)



其中虚线代表与式 (I) 的双环的氮原子连接的键,且

G¹代表N或C-B¹,

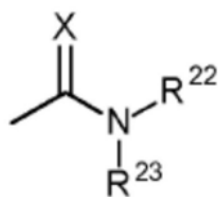
B¹代表选自如下的基团:氢和卤素,

B²代表氢,

T代表电子对,

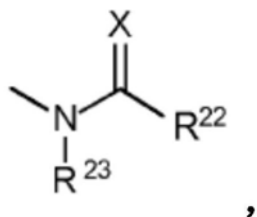
R¹代表氢,

R² c) 代表下式的基团



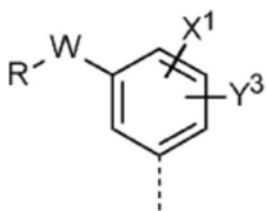
或者

R² d) 代表下式的基团



X代表氧,

R²²代表基团 (D-2)



(D-2)

其中虚线代表与基团c)中的氮原子或与基团d)中的碳原子连接的键,

X¹代表选自如下的基团:氢、卤素和C₁-C₆-烷基,

Y³代表选自如下的基团:氢、卤素和C₁-C₆-烷基,

W代表选自如下的基团:S和SO,且

R代表C₁-C₆-烷基,其任选地被卤素取代,

R²³代表选自氢和C₁-C₆-烷基的基团。

3. 组合物,其特征在于含有至少一种根据权利要求1或2所述的式(I)的化合物和常规的增量剂和/或表面活性剂。

4. 根据权利要求1或2所述的式(I)的化合物或根据权利要求3所述的组合物用于防治害虫的用途。

作为害虫防治剂的双环化合物

[0001] 本申请涉及新的双环化合物、包含这些化合物的组合物、其用于防治动物害虫的用途以及用于其制备的方法和中间体。

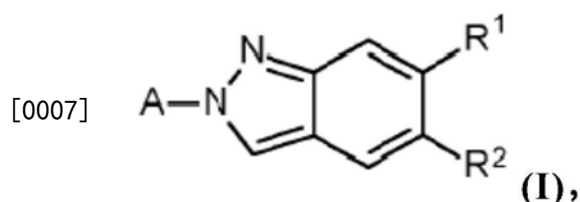
[0002] 近年来,已公开了具有杀昆虫特性的双环化合物(WO 2015/038503A1)。

[0003] WO 2003/090751 A1记载了尤其含有4-[[2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑基-5-基]氧基]片段的MMP-13选择性金属蛋白酶抑制剂的制备及制药用途。

[0004] 现代作物保护组合物必须满足许多要求,例如关于它们的作用程度、作用持久性和作用谱,以及可能的用途。毒性问题以及与其他活性化合物或制剂助剂的结合性问题起作用,合成活性化合物所需的费用问题亦是如此。此外,会产生抗性。仅是出于所有这些原因,不能认为对新的作物保护组合物的探寻已经完成,而是不断需要与已知化合物相比至少在个别方面具有改进的特性的新的化合物。

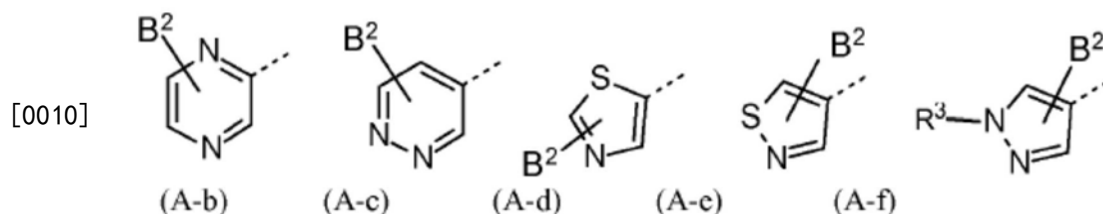
[0005] 本发明的一个目的是提供在各方面拓宽农药谱的化合物。

[0006] 该目的以及未明确说明但可以从本文所讨论的内容中看出或得出的其他目的均通过式(I)的化合物实现



[0008] 其中

[0009] A代表选自(A-b)至(A-f)的基团

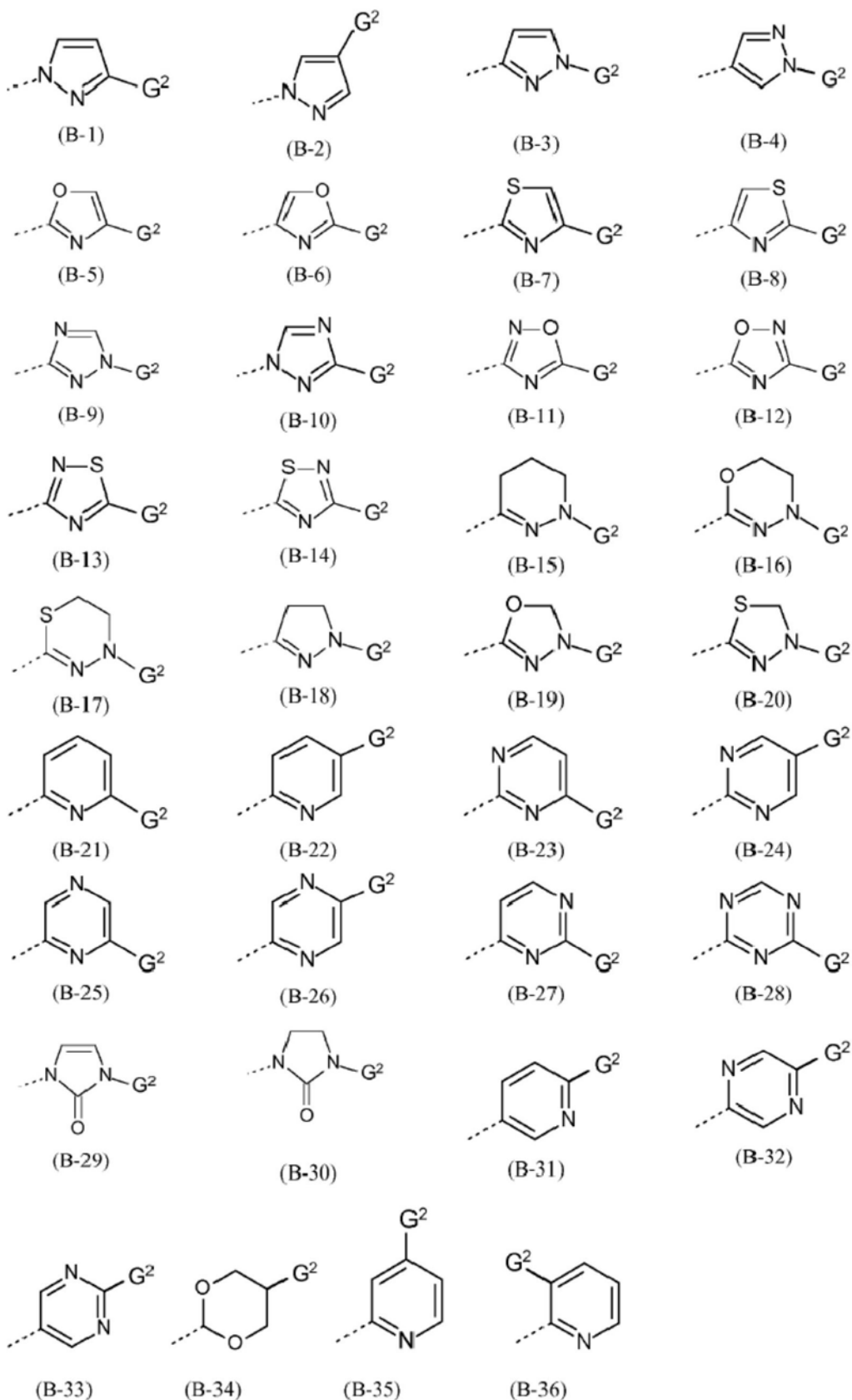


[0011] 其中虚线代表与式(I)的双环的氮原子连接的键,且

[0012] B²代表选自如下的基团:氢、卤素、氰基、硝基、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基以及各自任选取代的环烷基和环烯基,

[0013] R¹代表选自如下的基团:氢、烷基、烷氧基和氰基,

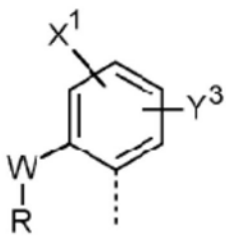
[0014] R^{2a})代表选自如下的B基团



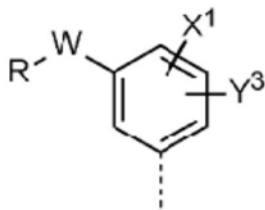
[0017] 其中虚线代表与式(I)的双环的碳原子连接的键,或者

[0018] R^{2b}) 代表选自 (D-1) 至 (D-3) 的基团

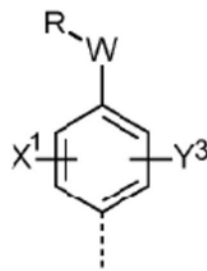
[0019]



(D-1)



(D-2)

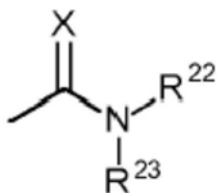


(D-3)

[0020] 其中虚线代表与式(I)的双环的碳原子连接的键,或者

[0021] R^{2c}代表下式的基团

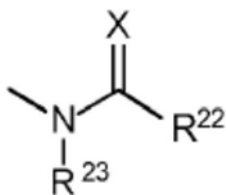
[0022]



[0023] 或者

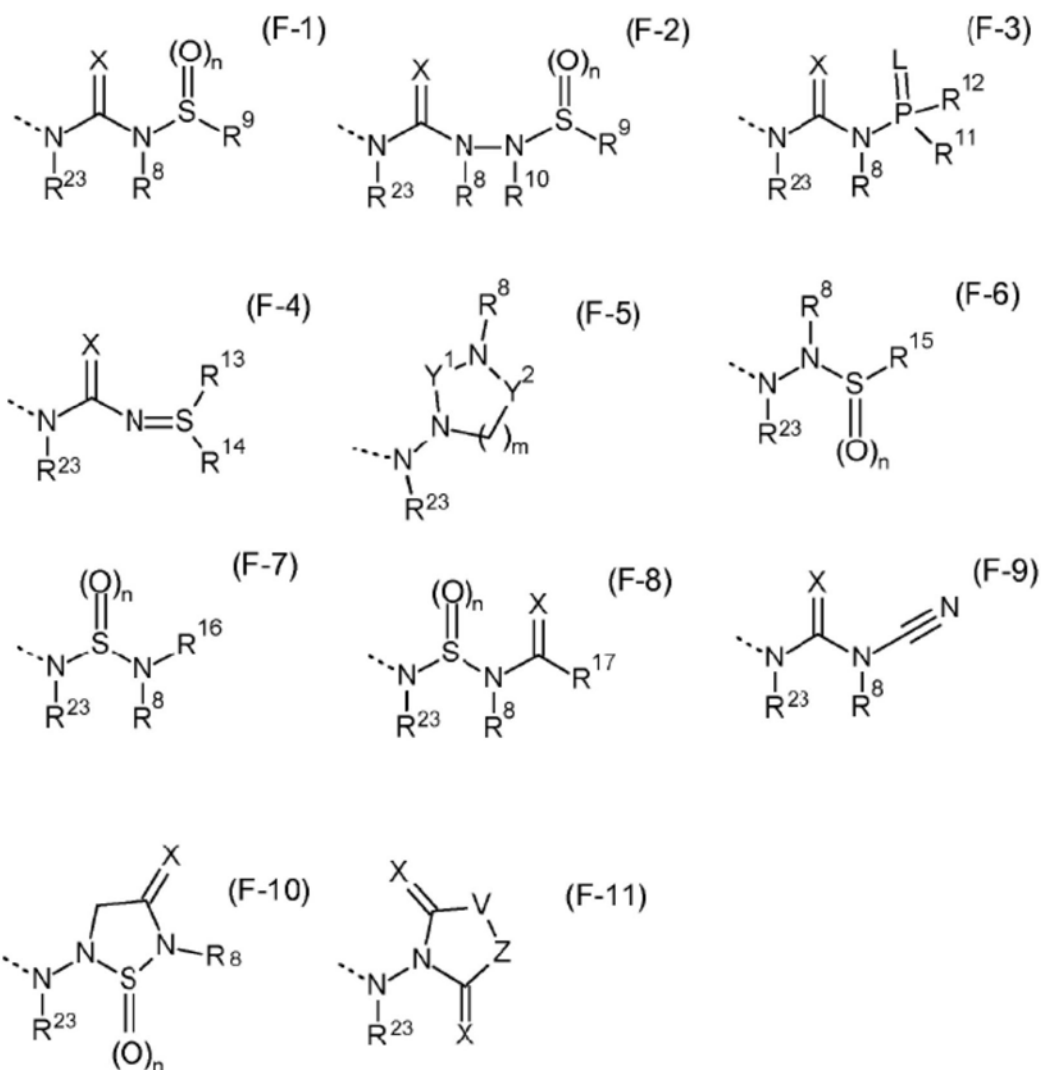
[0024] R^{2d}代表下式的基团

[0025]



[0026] 或者

[0027] R^{2e}代表选自(F-1)至(F-11)的基团



[0029] 其中虚线代表与式(I)中的碳原子连接的键,或者

[0030] R^{2f}代表选自如下的基团:卤代烷基、羧基和氨基,

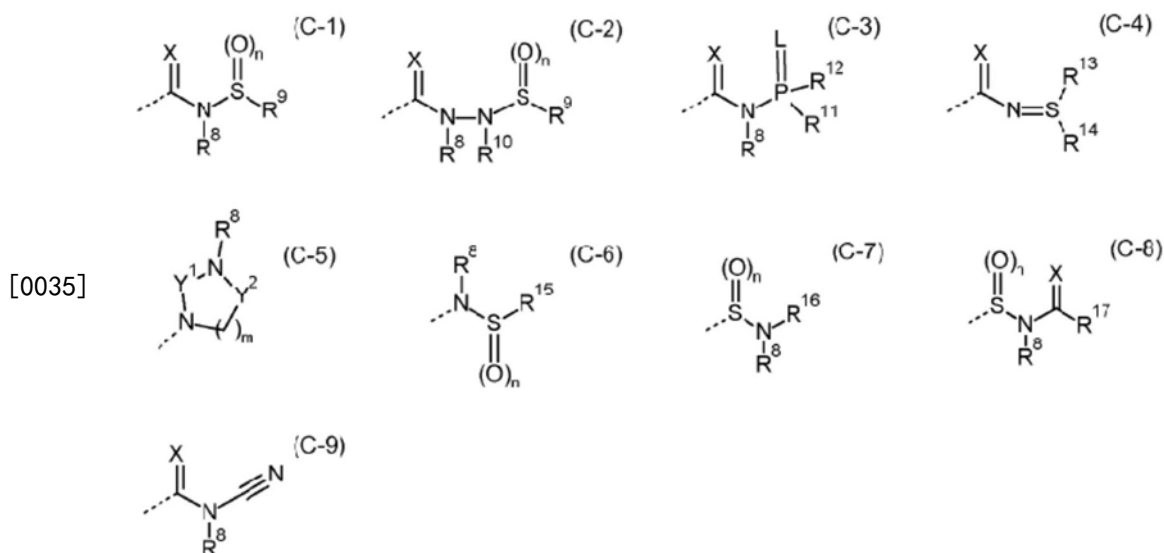
[0031] 其中

[0032] G²代表氢或选自如下的基团:卤素、硝基、氨基、氰基、烷基氨基、卤代烷基氨基、二烷基氨基、烷基、卤代烷基、任选取代的且任选被一个或多个杂原子间断的饱和或不饱和的环烷基、环烷基烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷氧基烷基、卤代烷氧基烷基、烷硫基烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基、二(烷氧基)烷基、二(卤代烷氧基)烷基、烷氧基(烷基硫烷基)烷基、烷氧基(烷基亚磺酰基)烷基、烷氧基(烷基磺酰基)烷基、二(烷基硫烷基)烷基、二(卤代烷基硫烷基)烷基、二(羟烷基硫烷基)烷基、烷氧基羰基、烷氧基羰基烷基、α-羟基亚氨基烷氧基羰基烷基、α-烷氧基亚氨基烷氧基羰基烷基、C(X²)NR³R⁴、NR⁶R⁷、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷硫基、卤代烷基亚磺酰基、卤代烷基磺酰基,杂环基基团:二氧杂环己基(dioxanyl)、二氧杂环戊基(dioxolanyl)、二氧杂环庚基(dioxepanyl)、二氧杂环辛基(dioxocanyl)、氧硫杂环己基(oxathianyl)、氧硫杂环戊基(oxathiolanyl)、氧硫杂环庚基(oxathiepanyl)、氧硫杂环辛基(oxathiocanyl)、二硫杂环己基(dithianyl)、二硫杂环戊基(dithiolanyl)、二硫杂环庚基(dithiepanyl)、二硫杂环辛基(dithiocanyl)、氧硫杂环己基氧化物(oxathianyl oxide)、氧硫杂环戊基氧化物(oxathiolanyl oxide)、氧硫

杂环庚基氧化物(oxathiepanyl oxide)、氧硫杂环辛基氧化物(oxathiocanyl oxide)、氧硫杂环己基二氧化物(oxathianyl dioxide)、氧硫杂环戊基二氧化物(oxathiolanyl dioxide)、氧硫杂环庚基二氧化物(oxathiepanyl dioxide)、氧硫杂环辛基二氧化物(oxathiocanyl dioxide)、吗啉基、三唑啉酮基(triazolinonyl)、噁唑啉基(oxazolinyl)、二氢噁二嗪基(dihydrooxadiazinyl)、二氢二噁嗪基(dihydrodioxazinyl)、二氢噁唑基(dihydrooxazolyl)、二氢噁嗪基(dihydrooxazinyl)和吡唑啉酮基(pyrazolinonyl)(其本身可被烷基、卤代烷基、烷氧基和烷氧基烷基取代),苯基(其本身可被卤素、氰基、硝基、烷基和卤代烷基取代),杂芳基基团:吡啶基、吡啶基N-氧化物、嘧啶基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、噻唑基、呋喃基、噻吩基、三唑基、四唑基、噁二唑基、噻二唑基、吡嗪基、三嗪基、四嗪基和异喹啉基(其本身可被卤素、硝基、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷氧基烷基、烷硫基、烷硫基烷基和环烷基取代),以及杂芳基烷基基团:三唑基烷基、吡啶基烷基、嘧啶基烷基和噁二唑基烷基(其本身可被卤素和烷基取代),

[0033] 或者

[0034] G^2 代表选自(C-1)至(C-9)的C基团



[0036] 其中虚线代表与B基团连接的键,

[0037] X代表氧或硫,

[0038] X^1 代表选自如下的基团:氢、卤素、氰基、硝基、烷基、卤代烷基、环烷基、烷氧基和卤代烷氧基,

[0039] X^2 代表氧、硫、 NR^5 或NOH,

[0040] L代表氧或硫,

[0041] V-Z代表 $R^{24}CH-CHR^{25}$ 或 $R^{24}C=CR^{25}$,

[0042] n代表1或2,

[0043] m代表1、2、3或4,

[0044] R代表 $NR^{18}R^{19}$ 或代表各自任选取代的下列基团:烷基、烯基、炔基、烷氧基烷基、烷基-S-烷基、烷基-S(O)-烷基、烷基-S(O)₂-烷基、 $R^{18}-CO-烷基$ 、 $NR^{18}R^{19}-CO-烷基$ 、环烷基、环烯基、环烷基烷基、环烯基烷基、杂环基、杂环基烷基、苯基、苯基烷基、杂芳基和杂芳基烷基,

[0045] R^3 代表氢或烷基,

[0046] R^4 代表选自如下的基团:氢、烷基、卤代烷基、氰基烷基、炔基、环烷基、环烷基烷基、烷氧基烷基、烷氧基羰基、烷氧基羰基烷基、烷硫基烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基、芳基、芳基烷基和杂芳基烷基,

[0047] R^5 代表选自如下的基团:氢、烷基、卤代烷基、氰基烷基、炔基、环烷基、环烷基烷基、烷氧基烷基、烷氧基羰基、烷氧基羰基烷基、烷硫基烷基、芳基、芳基烷基和杂芳基烷基,或者

[0048] R^3 和 R^4 与它们所连接的氮原子一起形成环,所述环可含有一个或多个选自氮、氧和硫的其他杂原子,或者

[0049] R^3 和 R^5 与它们所连接的氮原子一起形成环,

[0050] R^6 代表氢或烷基,

[0051] R^7 代表选自如下的基团:氢、烷基、卤代烷基、氰基烷基、炔基、环烷基、环烷基烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基、烷氧基羰基、烷氧基羰基烷基、烷硫基烷基、芳基、芳基烷基和杂芳基烷基,或者

[0052] R^6 和 R^7 与它们所连接的氮原子一起形成环,所述环可含有一个或多个选自氮、氧和硫的其他杂原子,

[0053] R^8 代表选自如下的基团:氢、烷基、卤代烷基、氰基烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烯基、烷氧基烷基,各自任选地被卤素取代的烷基羰基和烷基磺酰基,任选地被卤素取代的烷氧基羰基,任选地被卤素、烷基、烷氧基、卤代烷基和氰基取代的环烷基羰基,或者阳离子,或任选地被烷基或芳基烷基取代的铵离子,

[0054] R^9 代表选自如下的基团:各自任选取代的烷基、烯基和炔基;各自任选取代的环烷基、环烷基烷基和环烯基,其中所述环可含有至少一个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子;各自任选取代的芳基、杂芳基、芳基烷基和杂芳基烷基;以及任选取代的氨基,

[0055] 基团(C-1)和(F-1)中的 R^8 和 R^9 还可与它们所连接的N-S(O)_n基团一起形成饱和或不饱和的且任选取代的4至8元环,所述4至8元环可含有一个或多个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的其他杂原子和/或至少一个羰基,

[0056] R^{10} 代表氢或烷基,

[0057] 基团(C-2)和(F-2)中的 R^8 和 R^{10} 还可与它们所连接的氮原子一起代表饱和或不饱和的且任选取代的4至8元环,所述4至8元环可含有至少一个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的其他杂原子和/或至少一个羰基,

[0058] 基团(C-2)和(F-2)中的 R^9 和 R^{10} 还可与它们所连接的N-S(O)_n基团一起形成饱和或不饱和的且任选取代的4至8元环,所述4至8元环可含有一个或多个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的其他杂原子和/或至少一个羰基,

[0059] R^{11} 代表各自任选取代的下列基团:烷基、烯基、炔基、烷氧基、烯氧基、炔氧基、环烷基、环烷氧基(cycloalkyloxy)、环烯氧基、环烷基烷氧基、烷硫基、烯硫基、苯氧基、苯硫基、苄氧基、苄硫基、杂芳氧基、杂芳硫基、杂芳基烷氧基和杂芳基烷硫基,

[0060] R^{12} 代表各自任选取代的下列基团:烷基、烯基、炔基、烷氧基、烯氧基、炔氧基、环烷基、环烷氧基、环烯氧基、环烷基烷氧基、烷硫基、烯硫基、苯氧基、苯硫基、苄氧基、苄硫基、

杂芳氧基、杂芳硫基、杂芳基烷氧基和杂芳基烷硫基，

[0061] 基团 (C-3) 和 (F-3) 中的 R^{11} 和 R^{12} 还可与它们所连接的磷原子一起形成饱和或不饱和的且任选取代的5至7元环，所述5至7元环可含有一个或两个选自氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和硫的杂原子，

[0062] R^{13} 代表各自任选取代的下列基团：烷基、烯基、炔基、苯基和苯基烷基，

[0063] R^{14} 代表各自任选取代的下列基团：烷基、烯基、炔基、苯基和苯基烷基，

[0064] R^{15} 代表选自如下的基团：各自任选取代的烷基、烯基和炔基；各自任选取代的环烷基、环烷基烷基和环烯基，其中所述环可含有至少一个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子；各自任选取代的芳基、杂芳基、芳基烷基和杂芳基烷基；以及任选取代的氨基，

[0065] 基团 (C-6) 和 (F-6) 中的 R^8 和 R^{15} 还可与它们所连接的N-S(O)_n基团一起形成饱和或不饱和的且任选取代的4至8元环，所述4至8元环可含有一个或多个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的其他杂原子和/或至少一个羰基，

[0066] R^{16} 代表选自如下的基团：氢；各自任选取代的烷基、烷氧基、烯基和炔基；各自任选取代的环烷基、环烷基烷基和环烯基，其中所述环可含有至少一个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子；各自任选取代的芳基、杂芳基、芳基烷基和杂芳基烷基；以及任选取代的氨基，

[0067] 基团 (C-7) 和 (F-7) 中的 R^8 和 R^{16} 还可与它们所连接的氮原子一起形成饱和或不饱和的且任选取代的4至8元环，所述4至8元环可含有一个或多个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的其他杂原子和/或至少一个羰基，

[0068] R^{17} 代表选自如下的基团：各自任选取代的烷基、烷氧基、烯基和炔基；各自任选取代的环烷基、环烷基烷基和环烯基，其中所述环可含有至少一个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子；各自任选取代的芳基、杂芳基、芳基烷基和杂芳基烷基；以及任选取代的氨基，

[0069] 基团 (C-8) 和 (F-8) 中的 R^8 和 R^{17} 还可与它们所连接的N-C(X)基团一起形成饱和或不饱和的且任选取代的4至8元环，所述4至8元环可含有一个或多个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的其他杂原子和/或至少一个羰基，

[0070] R^{18} 代表选自如下的基团：氢；羟基；各自任选取代的烷基、烷氧基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基、烷基羰基、烷氧基羰基、烯基和炔基；各自任选取代的环烷基、环烷基烷基、环烯基和环烯基烷基，其中所述环可含有至少一个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子；各自任选取代的芳基、芳基烷基、杂芳基和杂芳基烷基；以及任选取代的氨基，

[0071] R^{19} 代表选自氢的基团，代表碱金属离子或碱土金属离子，或代表任选地被C₁-C₄-烷基单取代至四取代的铵离子，或代表各自任选地被卤素或氰基取代的烷基、烷氧基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、烷基亚磺酰基烷基和烷基磺酰基烷基，

[0072] Y^1 和 Y^2 彼此独立地代表C=O或S(O)₂，

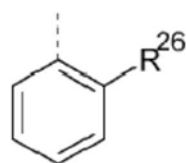
[0073] Y^3 代表选自如下的基团：氢、卤素、氰基、烷基、环烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基和NR²⁰R²¹，

[0074] W代表选自如下的基团：O、S、SO和SO₂，

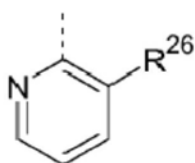
[0075] R^{22} 代表选自如下的基团：烷基，任选地被卤素、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基或氰基取代的环烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷氧基烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷硫基、卤代烷基亚磺酰基、卤代烷基磺酰基、烷硫基烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基、烷硫基烷氧基、烷基亚磺酰基烷氧基、烷基磺酰基烷氧基、卤代烷硫基烷基、卤代烷基亚磺酰基烷基、卤代烷基磺酰基烷基、烷硫基烯基、烷基亚磺酰基烯基、烷基磺酰基烯基、烯硫基烷基、烯基亚磺酰基烷基、烯基磺酰基烷基、烷基羰基烷基、卤代烷基羰基烷基、烷氧基烷基、卤代烷氧基烷基、烷氧基羰基烷基、卤代烷氧基羰基烷基、烷基氨基磺酰基、二(烷基氨基)磺酰基，或者，

[0076] 在 $R^2=d$ 的情况下，

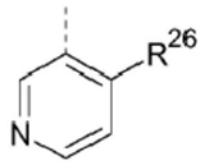
[0077] R^{22} 还代表任选取代的芳基，或代表选自E-1至E-51的基团



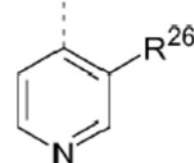
E-1



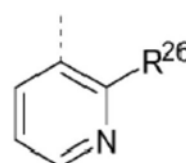
E-2



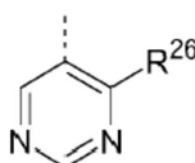
E-3



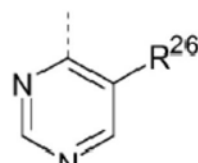
E-4



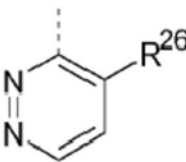
E-5



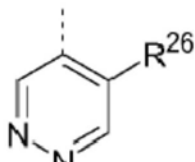
E-6



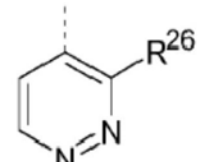
E-7



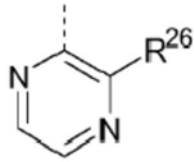
E-8



E-9

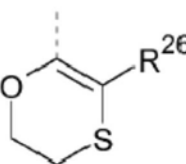


E-10

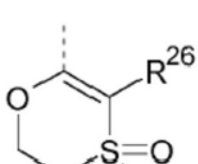
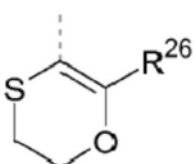


E-11

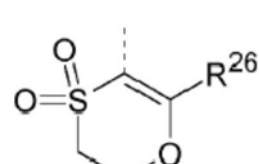
[0078]



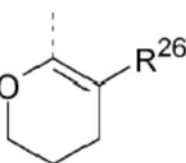
E-12



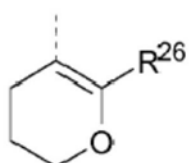
E-14



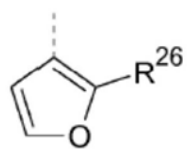
E-15



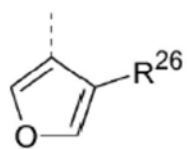
E-16



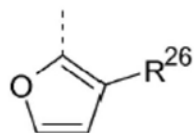
E-17



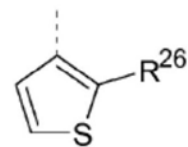
E-18



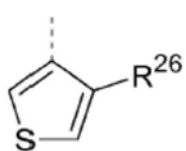
E-19



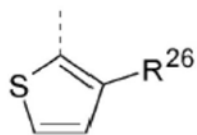
E-20



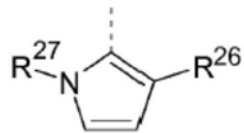
E-21



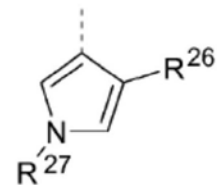
E-22



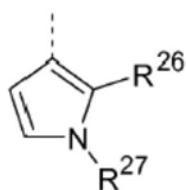
E-23



E-24

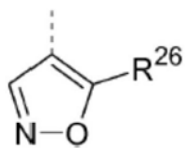


E-25

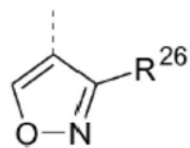


E-26

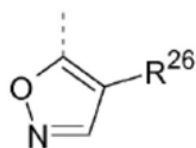
[0079]



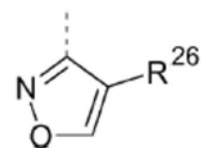
E-27



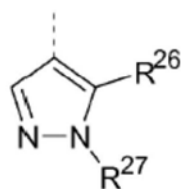
E-28



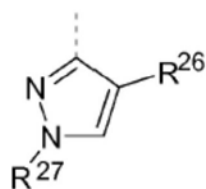
E-29



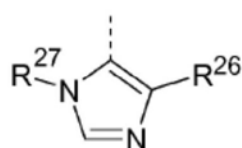
E-30



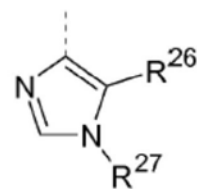
E-31



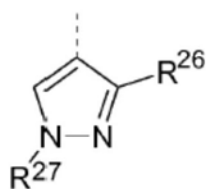
E-32



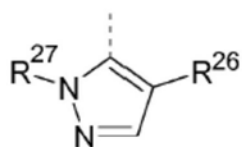
E-33



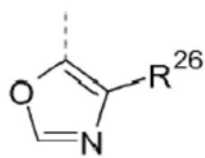
E-34



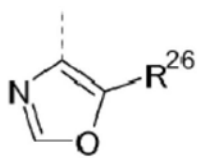
E-35



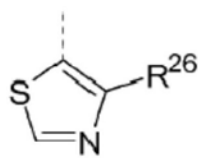
E-36



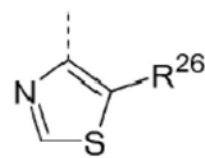
E-37



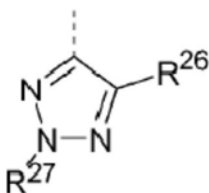
E-38



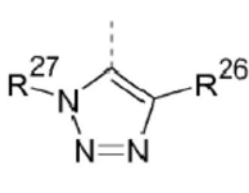
E-39



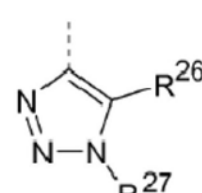
E-40



E-41

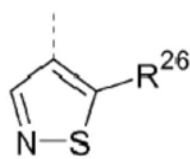


E-42

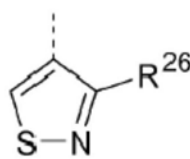


E-43

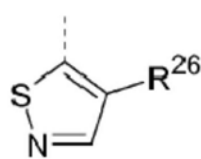
[0080]



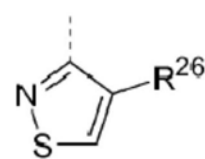
E-44



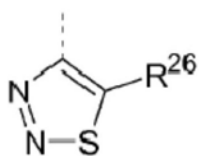
E-45



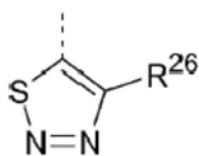
E-46



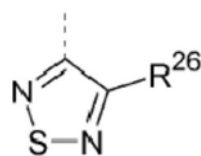
E-47



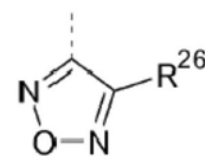
E-48



E-49



E-50



E-51

[0081] R^{20} 代表选自如下的基团:氢;卤素;氰基;硝基;氨基;羟基;和各自任选取代的下列基团:烷基、烯基、炔基、环烷基、环烷基烷基、烷氧基、烯氧基、炔氧基、环烷氧基、烷基羰基氧基、烯基羰基氧基、炔基羰基氧基、环烷基羰基氧基、烷氧基羰基氧基、烷基磺酰基氧基、烷基氨基、烯基氨基、炔基氨基、环烷基氨基、烷硫基、卤代烷硫基、烯硫基、炔硫基、环烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基羰基、烷氧基亚氨基烷基、烷氧基羰基、氨基羰基、烷基氨基羰基、二烷基氨基羰基、氨基硫代羰基、烷基氨基磺酰基、烷基磺酰基氨基、烷基羰基氨基、烯基羰基氨基、炔基羰基氨基、环烷基羰基氨基、烷氧基羰基氨基、烷硫基羰基氨基、二环烷基、芳基、芳氧基、杂芳基和杂芳氧基,其中所述取代基彼此独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、氨基、烷基和卤代烷基,

[0082] R^{21} 代表选自如下的基团:氢、烷基、环烷基、卤代烷基、烯基、炔基、环烷基烷基、氰基烷基、烷基羰基、烯基羰基、卤代烷基羰基、卤代烯基羰基、烷氧基烷基、烷氧基羰基、烷基磺酰基和卤代烷基磺酰基,

[0083] R^{23} 代表选自如下的基团:氢、烷基、烯基、炔基、环烷基、环烯基、烷氧基、烯氧基、炔氧基、环烷氧基、烷硫基烷基、烯硫基烷基、氰基烷基、烷氧基烷基,且

[0084] R^{24} 代表氢或各自任选取代的下列基团:烷基、烯基、炔基、苯基和苯基烷基,且

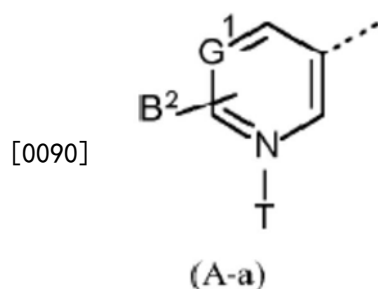
[0085] R^{25} 代表氢或各自任选取代的下列基团:烷基、烯基、炔基、苯基和苯基烷基,

[0086] R^{27} 代表氢或烷基,且

[0087] R^{26} 代表选自如下的基团：氢、烷基、卤代烷基、烯基、炔基、环烷基、环烷基烷基、烷氧基烷基、硫烷基烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基和氰基烷基，以及

[0088] 式(I)的化合物，其中

[0089] A代表A基团(A-a)



[0091] 其中虚线代表与式(I)的双环的氮原子连接的键，且

[0092] G^1 代表N或C- B^1 ，

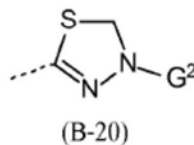
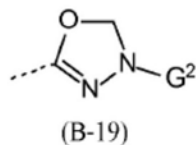
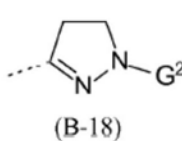
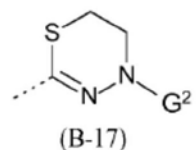
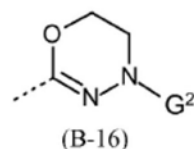
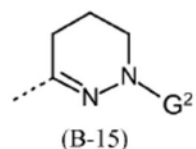
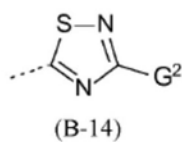
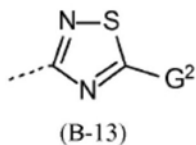
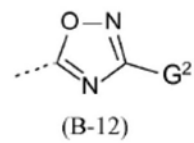
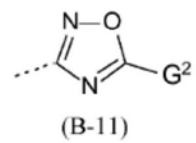
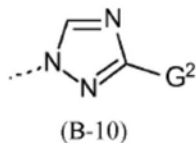
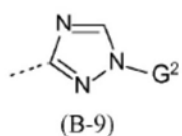
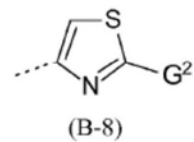
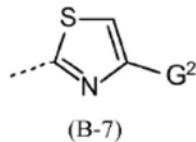
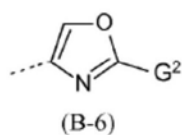
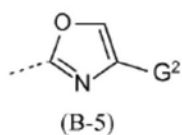
[0093] B^1 代表选自如下的基团：氢、卤素、氰基、硝基、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基以及各自任选取代的环烷基和环烯基，

[0094] B^2 代表选自如下的基团：氢、卤素、氰基、硝基、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基以及各自任选取代的环烷基和环烯基，

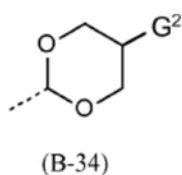
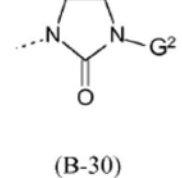
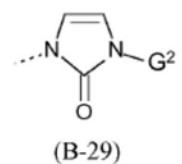
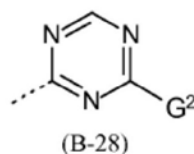
[0095] T代表氧或电子对，

[0096] R^1 代表选自如下的基团：氢、烷基、烷氧基和氰基，

[0097] R^{2a} 代表选自如下的B基团



[0098]

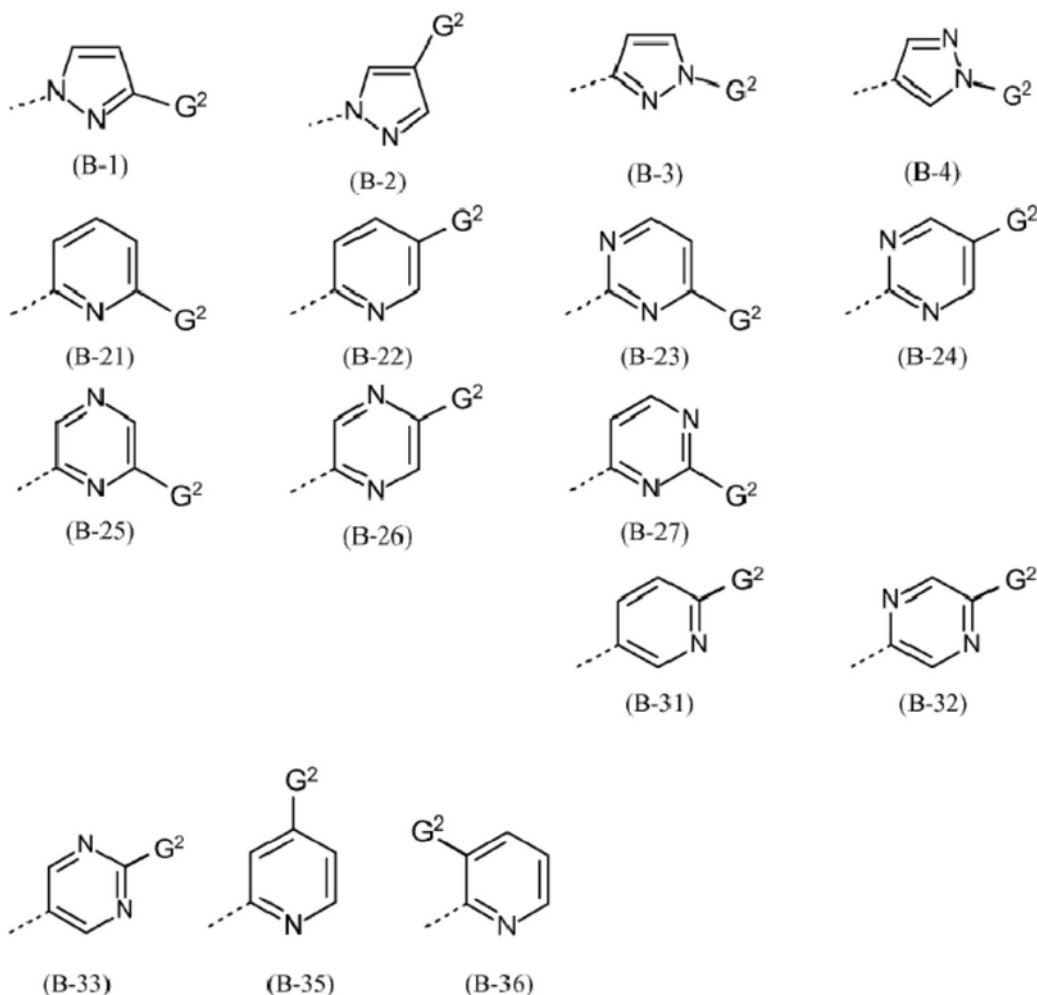


[0099] 其中虚线代表与式(I)的双环的碳原子连接的键,其中

[0100] G^2 代表氢或选自如下的基团:卤素、硝基、氨基、氰基、烷基氨基、卤代烷基氨基、二烷基氨基、烷基、卤代烷基、烷氧基羰基烷基、任选取代的且任选被一个或多个杂原子间断的饱和或不饱和的环烷基、环烷基烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷氧基烷基、卤代烷氧基烷基、烷硫基烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基、二(烷氧基)烷基、二(卤代烷氧基)烷基、烷氧基(烷基硫烷基)烷基、烷氧基(烷基亚磺酰基)烷基、烷氧基(烷基磺酰基)烷基、二(烷基硫烷基)烷基、二(卤代烷基硫烷基)烷基、二(羟烷基硫烷基)烷基、烷氧基羰基、烷氧基羰基烷基、 α -羟基亚氨基烷氧基羰基烷基、 α -烷氧基亚氨基烷氧基羰基烷基、 $C(X^2)NR^3R^4$ 、 NR^6R^7 、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷硫基、卤代烷基亚磺酰基、卤代烷基磺酰基

基,杂环基基团:二氧杂环己基、二氧杂环戊基、二氧杂环庚基、二氧杂环辛基、氧硫杂环己基、氧硫杂环戊基、氧硫杂环庚基、氧硫杂环辛基、二硫杂环己基、二硫杂环戊基、二硫杂环庚基、二硫杂环辛基、氧硫杂环己基氧化物、氧硫杂环戊基氧化物、氧硫杂环庚基氧化物、氧硫杂环辛基氧化物、氧硫杂环己基二氧化物、氧硫杂环戊基二氧化物、氧硫杂环庚基二氧化物、氧硫杂环辛基二氧化物、吗啉基、三唑啉酮基、噁唑啉基、二氢噁二嗪基、二氢二噁嗪基、二氢噁唑基、二氢噁嗪基和吡唑啉酮基(其本身可被烷基、卤代烷基、烷氧基和烷氧基烷基取代),苯基(其本身可被卤素、氰基、硝基、烷基和卤代烷基取代),杂芳基基团:吡啶基、吡啶基N-氧化物、嘧啶基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、噻唑基、呋喃基、噻吩基、三唑基、四唑基、噁二唑基、噻二唑基、吡嗪基、三嗪基、四嗪基和异喹啉基(其本身可被卤素、硝基、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷氧基烷基、烷硫基、烷硫基烷基和环烷基取代),以及杂芳基烷基基团:三唑基烷基、吡啶基烷基、嘧啶基烷基和噁二唑基烷基(其本身可被卤素和烷基取代),或者

[0101] R^{2aa} 代表以下B基团之一

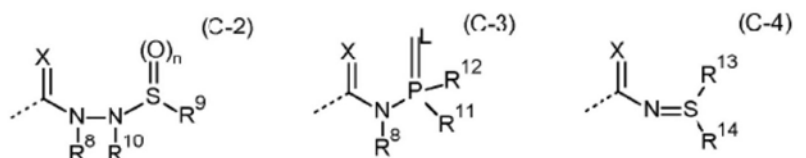


[0103] 其中虚线代表与式(I)的双环的碳原子连接的键,其中

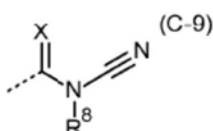
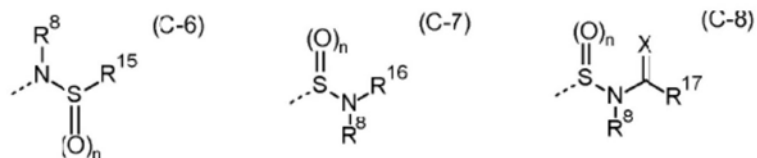
[0104] G^2 代表选自如下的基团:卤素、硝基、氨基、氰基、烷基氨基、卤代烷基氨基、二烷基氨基、任选取代的且任选被一个或多个杂原子间断的饱和或不饱和的环烷基、环烷基烷基、卤代烷氧基、烷氧基烷基、卤代烷氧基烷基、烷硫基烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基、卤代烷硫基烷基、卤代烷基亚磺酰基烷基、卤代烷基磺酰基烷基、二(烷氧基)烷基、二

(卤代烷氧基)烷基、烷氧基(烷基硫烷基)烷基、烷氧基(烷基亚磺酰基)烷基、烷氧基(烷基磺酰基)烷基、二(烷基硫烷基)烷基、二(卤代烷基硫烷基)烷基、二(羟烷基硫烷基)烷基、烷氧基羰基、烷氧基羰基烷基、 α -羟基亚氨基烷氧基羰基烷基、 α -烷氧基亚氨基烷氧基羰基烷基、 $C(X^2)NR^3R^4$ 、 NR^6R^7 、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷硫基、卤代烷基亚磺酰基、卤代烷基磺酰基,杂环基基团:二氧杂环己基、二氧杂环戊基、二氧杂环庚基、二氧杂环辛基、氧硫杂环己基、氧硫杂环戊基、氧硫杂环庚基、氧硫杂环辛基、二硫杂环己基、二硫杂环戊基、二硫杂环庚基、二硫杂环辛基、氧硫杂环己基氧化物、氧硫杂环戊基氧化物、氧硫杂环庚基氧化物、氧硫杂环辛基氧化物、氧硫杂环己基二氧化物、氧硫杂环戊基二氧化物、氧硫杂环庚基二氧化物、氧硫杂环辛基二氧化物、吗啉基、三唑啉酮基、噁唑啉基、二氢噁二嗪基、二氢二噁嗪基、二氢噁唑基、二氢噁嗪基和吡唑啉酮基(其本身可被烷基、卤代烷基、烷氧基和烷氧基烷基取代),苯基(其本身可被卤素、氰基、硝基、烷基和卤代烷基取代),杂芳基基团:咪唑基、吡唑基、噁唑基、呋喃基、噻吩基、三唑基、四唑基、噁二唑基、噻二唑基、吡嗪基、三嗪基、四嗪基和异噻啉基(其本身可被卤素、硝基、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷氧基烷基、烷硫基、烷硫基烷基和环烷基取代),以及杂芳基烷基基团:三唑基烷基、吡啶基烷基、嘧啶基烷基和噁二唑基烷基(其本身可被卤素和烷基取代),或者

[0105] G^2 如果 R^2 代表a)或aa)下所列基团之一,则 G^2 还代表选自如下的C基团

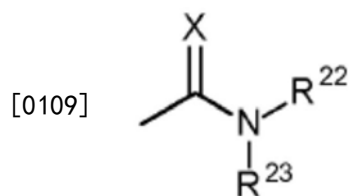


[0106]



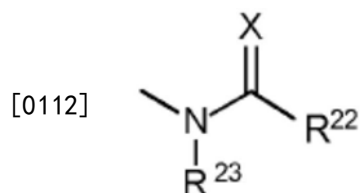
[0107] 其中虚线代表与B基团连接的键,或者

[0108] $R^2c)$ 代表下式的基团



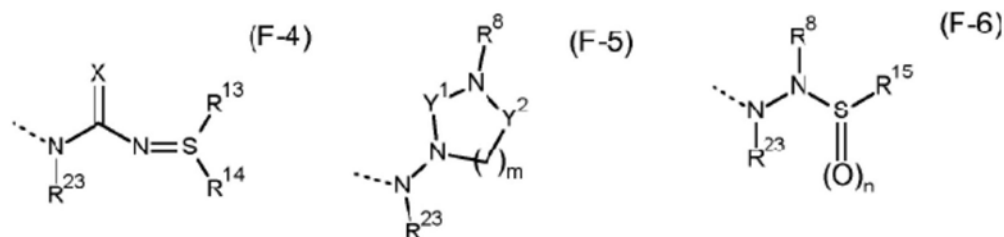
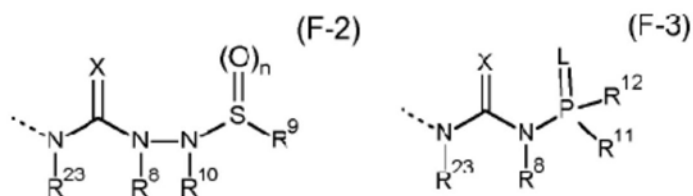
[0110] 或者

[0111] $R^2d)$ 代表下式的基团

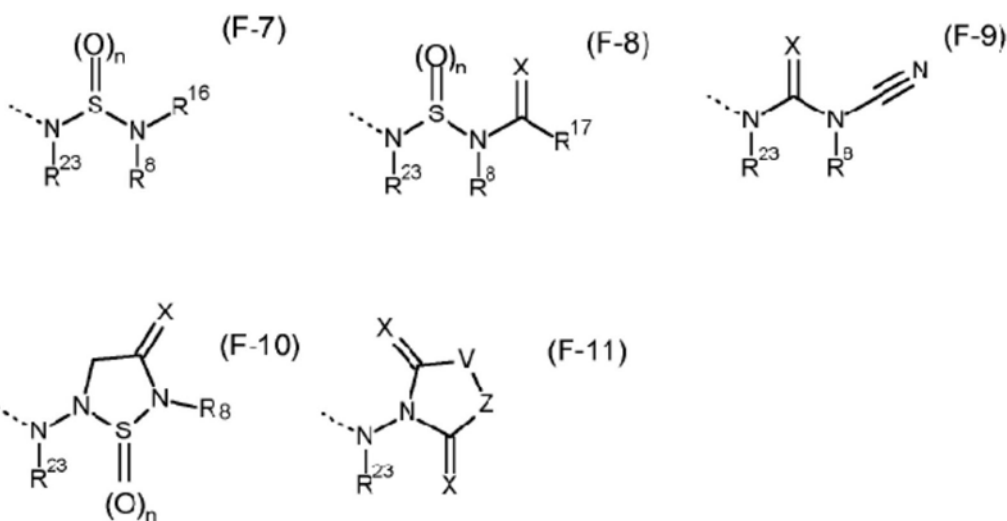


[0113] 或者

[0114] R^{2e}) 代表选自如下的F基团



[0115]



[0116] 其中虚线代表与式(I)中的碳原子连接的键,或者

[0117] R^{2f}) 代表选自如下的基团: 卤代烷基、羧基和氨基,

[0118] X代表氧或硫,

[0119] X²代表氧、硫、NR⁵或NOH,

[0120] L代表氧或硫,

[0121] V-Z代表R²⁴CH-CHR²⁵或R²⁴C=CR²⁵,

[0122] n代表1或2,

[0123] m代表1、2、3或4,

[0124] R³代表氢或烷基,

[0125] R⁴代表选自如下的基团: 氢、烷基、卤代烷基、氰基烷基、炔基、环烷基、环烷基烷

基、烷氧基烷基、烷氧基羰基、烷氧基羰基烷基、烷硫基烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基、芳基、芳基烷基和杂芳基烷基，

[0126] R^5 代表选自如下的基团：氢、烷基、卤代烷基、氰基烷基、炔基、环烷基、环烷基烷基、烷氧基烷基、烷氧基羰基、烷氧基羰基烷基、烷硫基烷基、芳基、芳基烷基和杂芳基烷基，或者

[0127] R^3 和 R^4 与它们所连接的氮原子一起形成环，所述环可含有一个或多个选自氮、氧和硫的其他杂原子，或者

[0128] R^3 和 R^5 与它们所连接的氮原子一起形成环，

[0129] R^6 代表氢或烷基，

[0130] R^7 代表选自如下的基团：氢、烷基、卤代烷基、氰基烷基、炔基、环烷基、环烷基烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基、烷氧基羰基、烷氧基羰基烷基、烷硫基烷基、芳基、芳基烷基和杂芳基烷基，或者

[0131] R^6 和 R^7 与它们所连接的氮原子一起形成环，所述环可含有一个或多个选自氮、氧和硫的其他杂原子，

[0132] R^8 代表选自如下的基团：氢、烷基、卤代烷基、氰基烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烯基、烷氧基烷基，各自任选地被卤素取代的烷基羰基和烷基磺酰基，任选地被卤素取代的烷氧基羰基，任选地被卤素、烷基、烷氧基、卤代烷基和氰基取代的环烷基羰基，或者阳离子或任选地被烷基或芳基烷基取代的铵离子，

[0133] R^9 代表选自如下的基团：各自任选取代的烷基、烯基和炔基；各自任选取代的环烷基、环烷基烷基和环烯基，其中所述环可含有至少一个选自硫、氧（其中氧原子不能彼此直接相邻）和氮的杂原子；各自任选取代的芳基、杂芳基、芳基烷基和杂芳基烷基；以及任选取代的氨基，

[0134] R^{10} 代表氢或烷基，

[0135] 基团 (C-2) 和 (F-2) 中的 R^8 和 R^{10} 还可与它们所连接的氮原子一起代表饱和或不饱和的且任选取代的4至8元环，所述4至8元环可含有至少一个选自硫、氧（其中氧原子不能彼此直接相邻）和氮的其他杂原子和/或至少一个羰基，

[0136] 基团 (C-2) 和 (F-2) 中的 R^9 和 R^{10} 还可与它们所连接的N-S(O)_n基团一起形成饱和或不饱和的且任选取代的4至8元环，所述4至8元环可含有一个或多个选自硫、氧（其中氧原子不能彼此直接相邻）和氮的其他杂原子和/或至少一个羰基，

[0137] R^{11} 代表各自任选取代的下列基团：烷基、烯基、炔基、烷氧基、烯氧基、炔氧基、环烷基、环烷氧基、环烯氧基、环烷基烷氧基、烷硫基、烯硫基、苯氧基、苯硫基、苄氧基、苄硫基、杂芳氧基、杂芳硫基、杂芳基烷氧基和杂芳基烷硫基，

[0138] R^{12} 代表各自任选取代的下列基团：烷基、烯基、炔基、烷氧基、烯氧基、炔氧基、环烷基、环烷氧基、环烯氧基、环烷基烷氧基、烷硫基、烯硫基、苯氧基、苯硫基、苄氧基、苄硫基、杂芳氧基、杂芳硫基、杂芳基烷氧基和杂芳基烷硫基，

[0139] 基团 (C-3) 和 (F-3) 中的 R^{11} 和 R^{12} 还可与它们所连接的磷原子一起形成饱和或不饱和的且任选取代的5至7元环，所述5至7元环可含有一个或两个选自氧（其中氧原子不能彼此直接相邻）和硫的杂原子，

[0140] R^{13} 代表各自任选取代的下列基团：烷基、烯基、炔基、苯基和苯基烷基，

[0141] R^{14} 代表各自任选取代的下列基团:烷基、烯基、炔基、苯基和苯基烷基,

[0142] R^{15} 代表选自如下的基团:各自任选取代的烷基、烯基和炔基;各自任选取代的环烷基、环烷基烷基和环烯基,其中所述环可含有至少一个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子;各自任选取代的芳基、杂芳基、芳基烷基和杂芳基烷基;以及任选取代的氨基,

[0143] 基团(C-6)和(F-6)中的 R^8 和 R^{15} 还可与它们所连接的N-S(O)_n基团一起形成饱和或不饱和的且任选取代的4至8元环,所述4至8元环可含有一个或多个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的其他杂原子和/或至少一个羰基,

[0144] R^{16} 代表选自如下的基团:氢;各自任选取代的烷基、烷氧基、烯基和炔基;各自任选取代的环烷基、环烷基烷基和环烯基,其中所述环可含有至少一个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子;各自任选取代的芳基、杂芳基、芳基烷基和杂芳基烷基;以及任选取代的氨基,

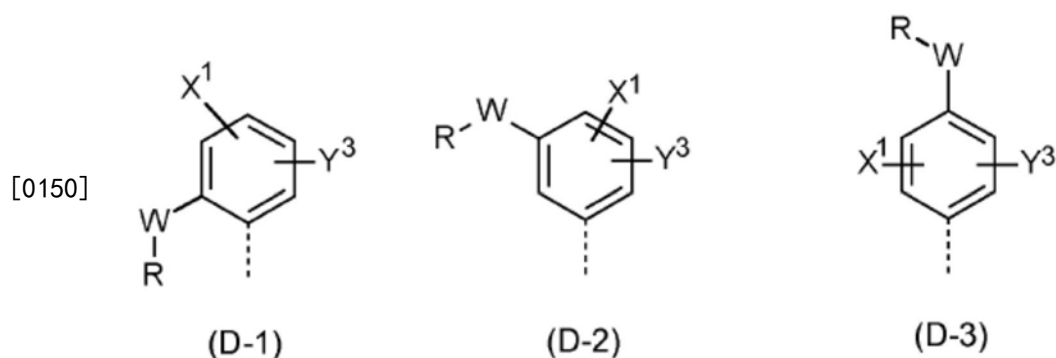
[0145] 基团(C-7)和(F-7)中的 R^8 和 R^{16} 还可与它们所连接的氮原子一起形成饱和或不饱和的且任选取代的4至8元环,所述4至8元环可含有一个或多个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的其他杂原子和/或至少一个羰基,

[0146] R^{17} 代表选自如下的基团:各自任选取代的烷基、烷氧基、烯基和炔基;各自任选取代的环烷基、环烷基烷基和环烯基,其中所述环可含有至少一个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子;各自任选取代的芳基、杂芳基、芳基烷基和杂芳基烷基;以及任选取代的氨基,

[0147] 基团(C-8)和(F-8)中的 R^8 和 R^{17} 还可与它们所连接的N-C(X)基团一起形成饱和或不饱和的且任选取代的4至8元环,所述4至8元环可含有一个或多个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的其他杂原子和/或至少一个羰基,

[0148] Y^1 和 Y^2 彼此独立地代表C=O或S(O)₂,

[0149] R^{22} 代表选自(D-1)至(D-3)的基团



[0151] 其中虚线代表与基团c)中的氮原子或与基团d)中的碳原子连接的键,

[0152] X^1 代表选自如下的基团:氢、卤素、氰基、硝基、烷基、卤代烷基、环烷基、烷氧基和卤代烷氧基,

[0153] Y^3 代表选自如下的基团:氢、卤素、氰基、烷基、环烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基和NR²⁰R²¹,

[0154] W代表选自如下的基团:S、SO和SO₂,且

[0155] R代表NR¹⁸R¹⁹或代表各自任选取代的下列基团:烷基、烯基、炔基、烷氧基烷基、烷

基-S-烷基、烷基-S(O)-烷基、烷基-S(O)₂-烷基、R¹⁸-CO-烷基、NR¹⁸R¹⁹-CO-烷基、环烷基、环烯基、环烷基烷基、环烯基烷基、杂环基、杂环基烷基、苯基、苯基烷基、杂芳基和杂芳基烷基，

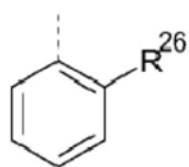
[0156] R¹⁸代表选自如下的基团：氢；羟基；各自任选取代的烷基、烷氧基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基、烷基羰基、烷氧基羰基、烯基和炔基；各自任选取代的环烷基、环烷基烷基、环烯基和环烯基烷基，其中所述环可含有至少一个选自硫、氧（其中氧原子不能彼此直接相邻）和氮的杂原子；各自任选取代的芳基、芳基烷基、杂芳基和杂芳基烷基；以及任选取代的氨基，

[0157] R¹⁹代表选自氢的基团，代表碱金属离子或碱土金属离子，或代表任选地被C₁-C₄-烷基单取代至四取代的铵离子，或代表各自任选地被卤素或氰基取代的烷基、烷氧基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、烷基亚磺酰基烷基和烷基磺酰基烷基基团，

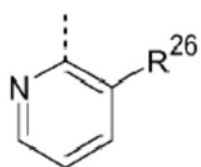
[0158] R²⁰代表选自如下的基团：氢；卤素；氰基；硝基；氨基；羟基；和各自任选取代的下列基团：烷基、烯基、炔基、环烷基、环烷基烷基、烷氧基、烯氧基、炔氧基、环烷氧基、烷基羰基氧基、烯基羰基氧基、炔基羰基氧基、环烷基羰基氧基、烷氧基羰基氧基、烷基磺酰基氧基、烷基氨基、烯基氨基、炔基氨基、环烷基氨基、烷硫基、卤代烷硫基、烯硫基、炔硫基、环烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、烷基羰基、烷氧基亚氨基烷基、烷氧基羰基、氨基羰基、烷基氨基羰基、二烷基氨基羰基、氨基硫代羰基、烷基氨基磺酰基、烷基磺酰基氨基、烷基羰基氨基、烯基羰基氨基、炔基羰基氨基、环烷基羰基氨基、烷氧基羰基氨基、烷硫基羰基氨基、二环烷基、芳基、芳氧基、杂芳基和杂芳氧基，其中所述取代基彼此独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、氨基、烷基和卤代烷基，

[0159] R²¹代表选自如下的基团：氢、烷基、环烷基、卤代烷基、烯基、炔基、环烷基烷基、氰基烷基、烷基羰基、烯基羰基、卤代烷基羰基、卤代烯基羰基、烷氧基烷基、烷氧基羰基、烷基磺酰基和卤代烷基磺酰基，或者

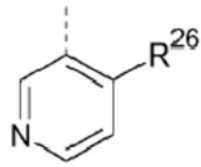
[0160] R²²代表选自E-1至E-51的基团



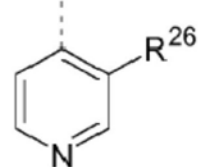
E-1



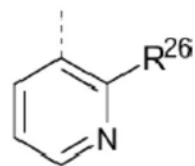
E-2



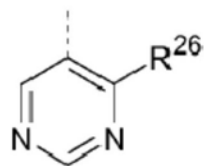
E-3



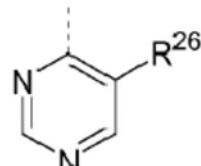
E-4



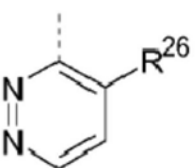
E-5



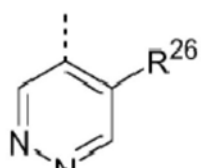
E-6



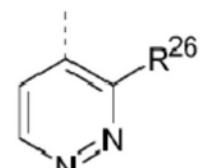
E-7



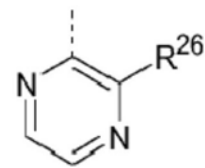
E-8



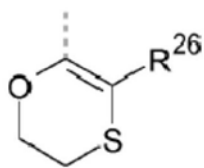
E-9



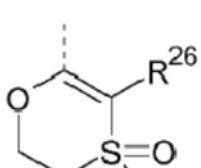
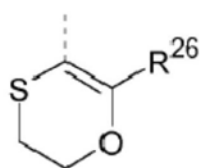
E-10



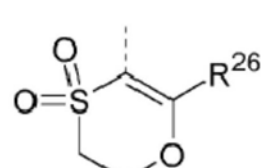
E-11



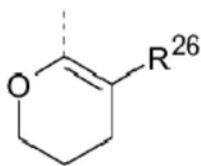
E-12



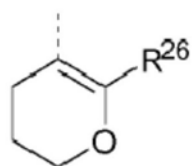
E-14



E-15

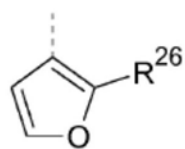


E-16

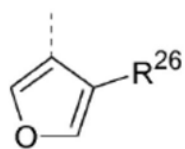


E-17

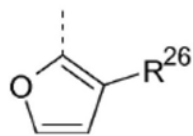
[0161]



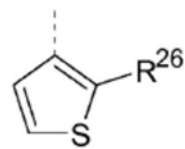
E-18



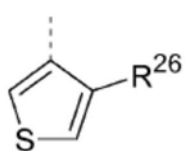
E-19



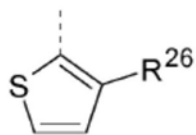
E-20



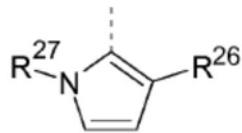
E-21



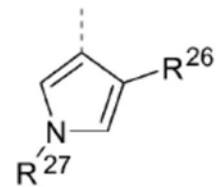
E-22



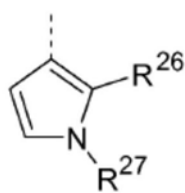
E-23



E-24

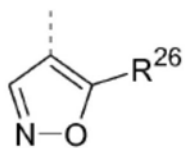


E-25

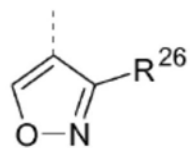


E-26

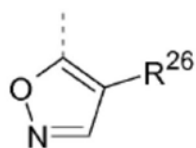
[0162]



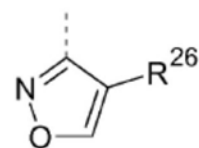
E-27



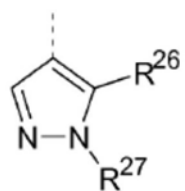
E-28



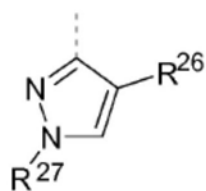
E-29



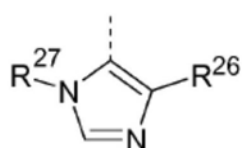
E-30



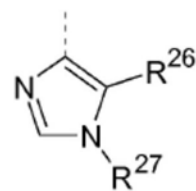
E-31



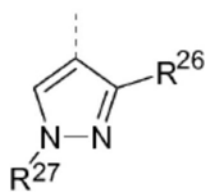
E-32



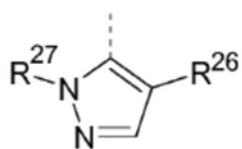
E-33



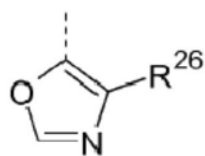
E-34



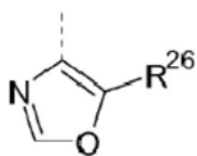
E-35



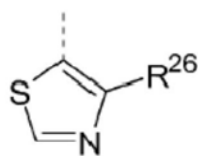
E-36



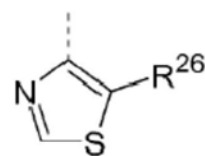
E-37



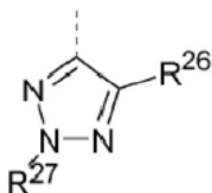
E-38



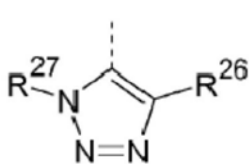
E-39



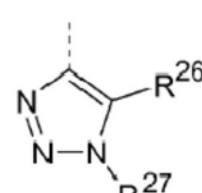
E-40



E-41

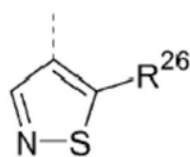


E-42

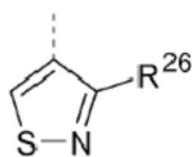


E-43

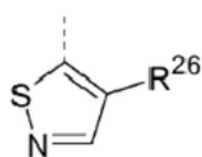
[0163]



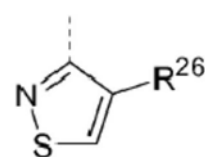
E-44



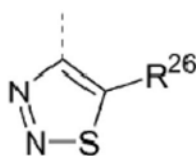
E-45



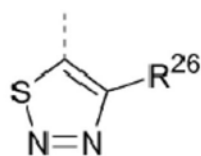
E-46



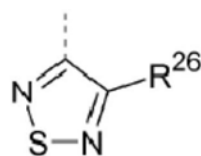
E-47



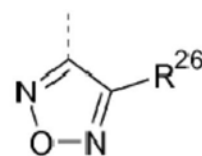
E-48



E-49



E-50



E-51

[0164] R^{23} 代表选自如下的基团:氢、烷基、烯基、炔基、环烷基、环烯基、烷氧基、烯氧基、炔氧基、环烷氧基、烷硫基烷基、烯硫基烷基、氰基烷基、烷氧基烷基,

[0165] R^{24} 代表氢或各自任选取代的下列基团:烷基、烯基、炔基、苯基和苯基烷基,且

[0166] R^{25} 代表氢或各自任选取代的下列基团:烷基、烯基、炔基、苯基和苯基烷基,

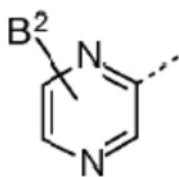
[0167] R^{27} 代表氢或烷基,且

[0168] R^{26} 代表氢、烷基、卤代烷基、烯基、炔基、环烷基、环烷基烷基、烷氧基烷基、烷基硫烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基或氰基烷基。

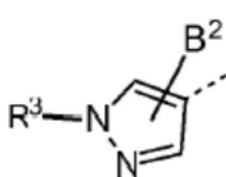
[0169] 另外,已发现式(I)的化合物以及表1中所列的未涵盖在式(I)中的化合物作为农药具有良好的功效,例如对抗节肢动物且尤其是昆虫,并且还通常具有与植物、尤其是作物植物非常好的相容性,和/或具有有利的毒理学和/或有利的的环境相关特性。

[0170] 优选范围(1):优选下列式(I)的化合物,其中

[0171] A代表选自(A-b)和(A-f)的A基团



(A-b)



(A-f)

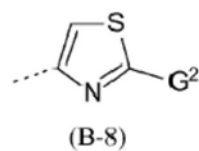
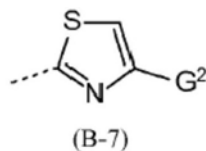
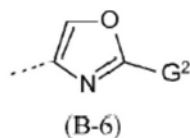
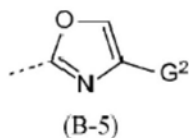
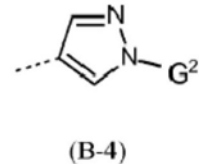
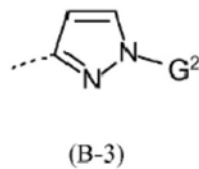
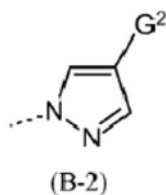
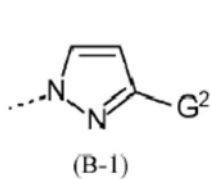
[0172]

[0173] 其中虚线代表与式(I)的双环的氮原子连接的键,且

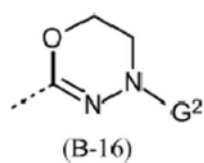
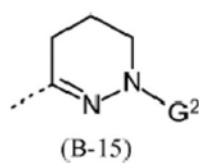
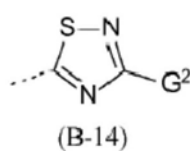
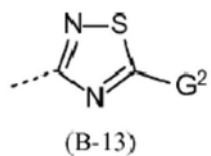
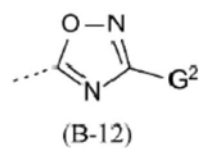
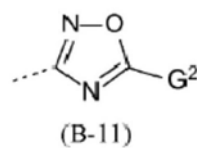
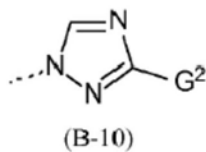
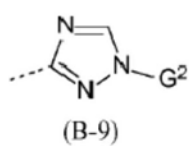
[0174] B^2 代表选自氢、卤素、 C_1-C_6 -烷基和 C_1-C_4 -卤代烷基的基团,

[0175] R^1 代表选自氢、 C_1-C_6 -烷基和 C_1-C_6 -烷氧基的基团,

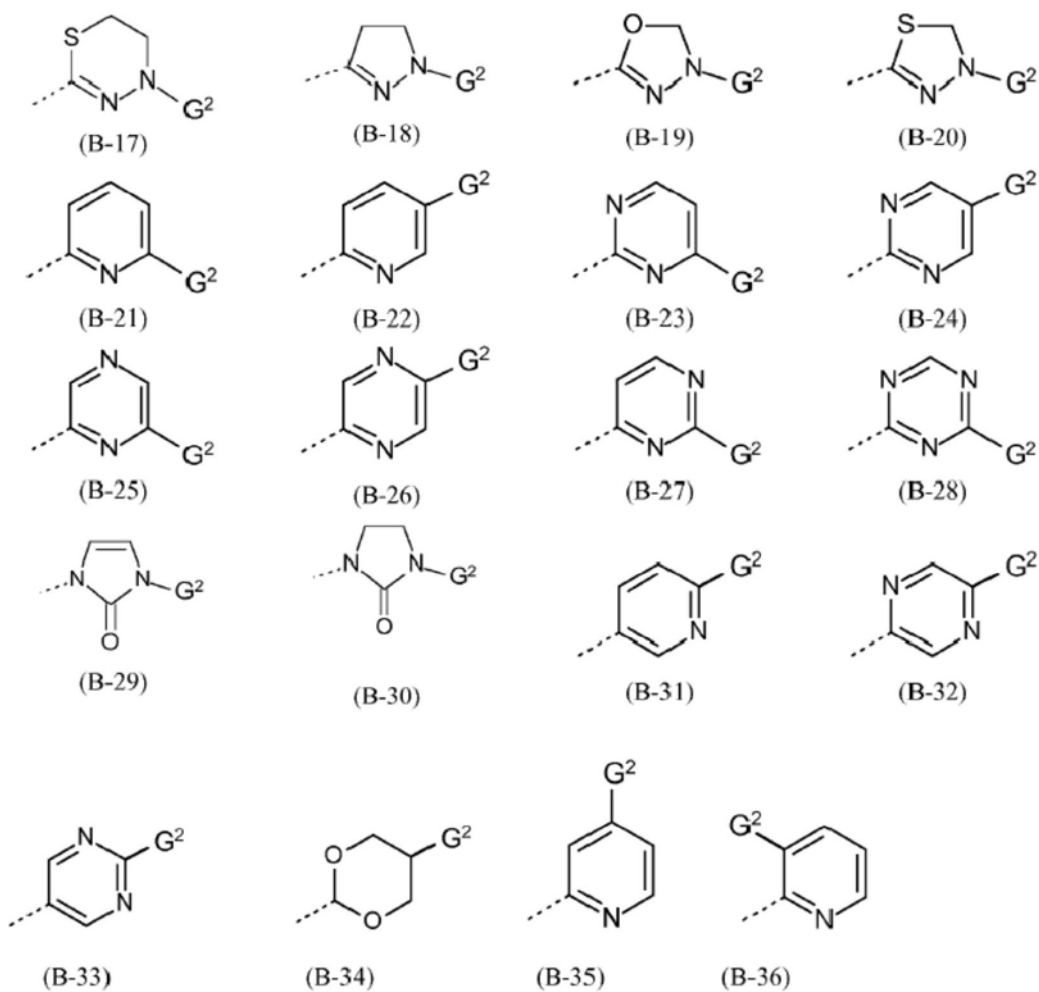
[0176] R^2 a) 代表选自如下的B基团



[0177]



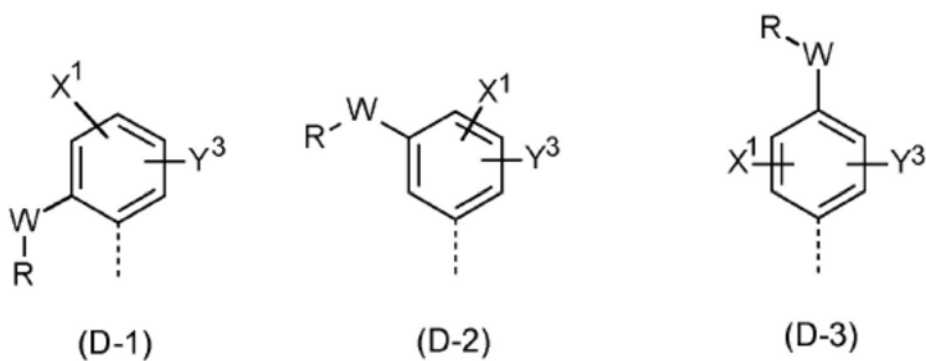
[0178]



[0179] 其中虚线代表与式(I)的双环的碳原子连接的键,或者

[0180] R^{2b} 代表选自 (D-1) 至 (D-3) 的基团

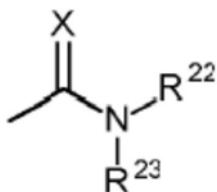
[0181]



[0182] 其中虚线代表与式(I)的双环的碳原子连接的键,或者

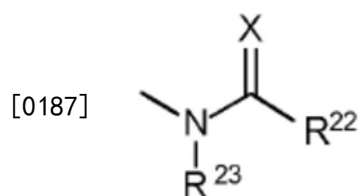
[0183] R^{2c} 代表下式的基团

[0184]



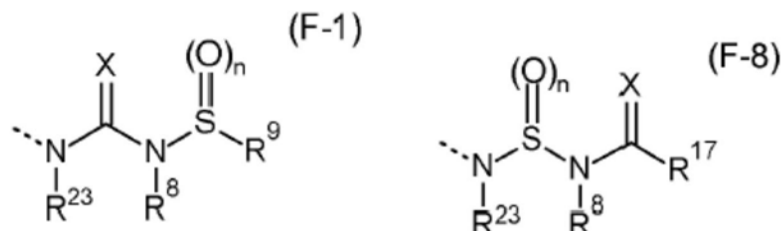
[0185] 或者

[0186] R^{2d} 代表下式的基团

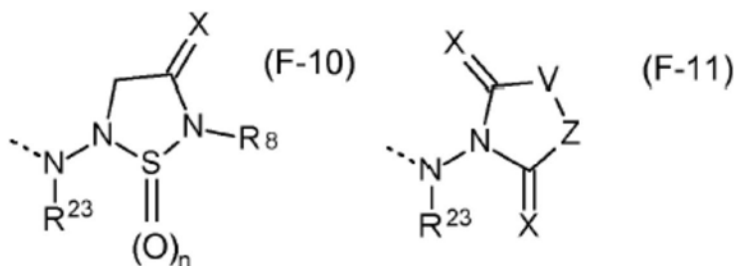


[0188] 或者

[0189] R^{2e} 代表选自 (F-1)、(F-8)、(F-10) 和 (F-11) 的基团



[0190]



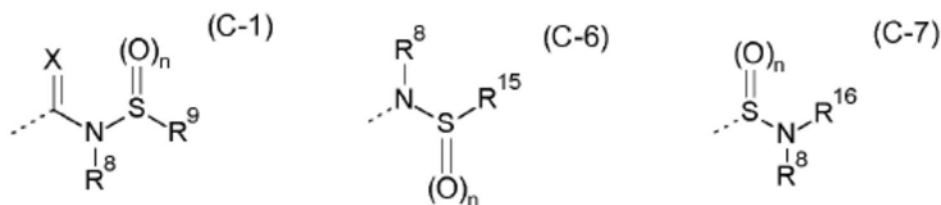
[0191] 其中虚线代表与式 (I) 中的碳原子连接的键, 或者

[0192] R^{2f} 代表选自如下的基团: C_1-C_6 -卤代烷基、羧基和氨基, 其中

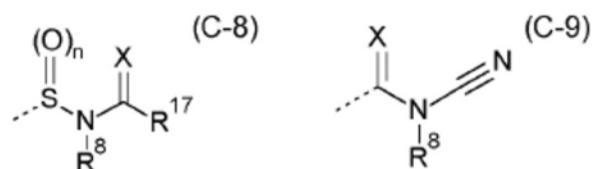
[0193] G^2 代表氢, 或代表选自如下的基团: 卤素、硝基、氨基、氰基、 C_1-C_4 -烷基氨基、卤代- C_1-C_4 -烷基氨基、二- (C_1-C_4 -烷基)-氨基、 C_1-C_4 -烷基、卤代- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基- C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_3-C_6 -环烯基、 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、卤代- C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、卤代- C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、二- (C_1-C_4 -烷氧基)- C_1-C_4 -烷基、二- (卤代- C_1-C_4 -烷氧基)- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- (C_1-C_4 -烷基硫烷基)- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- (C_1-C_4 -烷基亚磺酰基)- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- (C_1-C_4 -烷基磺酰基)- C_1-C_4 -烷基、二- (C_1-C_4 -烷基硫烷基)- C_1-C_4 -烷基、二- (卤代- C_1-C_4 -烷基硫烷基)- C_1-C_4 -烷基、二- (羟基- C_1-C_4 -烷基硫烷基)- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基- C_1-C_4 -烷基、 α -羟基亚氨基- C_1-C_4 -烷氧基羰基- C_1-C_4 -烷基、 α - C_1-C_4 -烷氧基亚氨基- C_1-C_4 -烷氧基羰基- C_1-C_4 -烷基、 $C(X^2)NR^3R^4$ 、 NR^6R^7 、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷硫基、 C_1-C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基, 杂环基基团: 二氧杂环己基、二氧杂环戊基、二氧杂环庚基、二氧杂环辛基、氧硫杂环己基、氧硫杂环戊基、氧硫杂环庚基、氧硫杂环辛基、二硫杂环己基、二硫杂环戊基、二硫杂环庚基、二硫杂环辛基、氧硫杂环己基氧化物、氧硫杂环戊基氧化物、氧硫杂环庚基氧化物、氧硫杂环辛基氧化物、氧硫杂环己基二氧化物、氧硫杂环戊基二氧化物、氧硫杂环庚基二氧化物、氧硫杂环辛基二氧化物、吗啉基、三唑啉酮基、噁唑啉基、二氢噁二嗪基、二氢二噁嗪基、二氢噁唑基、二氢噁嗪基和吡唑啉酮基 (其本身可被 C_1-C_4 -烷基、卤代- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基和 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基取代), 苯基 (其本身可被卤素、氰基、硝基、 C_1-C_4 -烷基和卤代- C_1-C_4 -烷

基取代), 杂芳基基团: 吡啶基、吡啶基N-氧化物、嘧啶基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、噻唑基、呋喃基、噻吩基、三唑基、四唑基、噁二唑基、噻二唑基、吡嗪基、三嗪基、四嗪基和异喹啉基(其本身可被卤素、硝基、C₁-C₄-烷基、卤代-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、卤代-C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷硫基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基和C₃-C₆-环烷基取代), 以及杂芳基-C₁-C₄-烷基基团: 三唑基-C₁-C₄-烷基、吡啶基-C₁-C₄-烷基、嘧啶基-C₁-C₄-烷基和噁二唑基-C₁-C₄-烷基(其本身可被卤素和C₁-C₄-烷基取代), 或者

[0194] G²代表选自(C-1)和(C-6)至(C-9)的基团



[0195]



[0196] 其中虚线代表与B基团连接的键,

[0197] X代表氧或硫,

[0198] X¹代表选自如下的基团: 氢、卤素、氰基、硝基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-烷氧基和C₁-C₆-卤代烷氧基,

[0199] X²代表氧、硫、NR⁵或NOH,

[0200] V-Z代表R²⁴CH-CHR²⁵或R²⁴C=CR²⁵,

[0201] n代表1或2,

[0202] R代表NR¹⁸R¹⁹, 或代表下述基团: 各自任选被卤素、氧(得到C=O)或氰基单取代或二取代的C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-烯基、C₃-C₆-炔基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₆-烷基-S-C₁-C₄-烷基、C₁-C₆-烷基-S(O)-C₁-C₄-烷基、C₁-C₆-烷基-S(O)₂-C₁-C₄-烷基、R¹⁸-CO-C₁-C₄-烷基、NR¹⁸R¹⁹-CO-C₁-C₄-烷基, 任选被氧(得到C=O)、C₁-C₄-烷基、C₃-C₈-环烷基、C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷基取代的C₃-C₆-环烷基, 任选被氧(得到C=O)、C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷基单取代或二取代的C₃-C₈-环烯基, 任选被氧(得到C=O)、C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷基单取代或二取代的C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基, 任选被氧(得到C=O)、C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷基单取代或二取代的杂环基, 任选被氧(得到C=O)、C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷基单取代或二取代的杂环基-C₁-C₄-烷基, 或各自任选被卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基或C₁-C₄-卤代烷氧基单取代至三取代的苯基、苯基-C₁-C₄-烷基、杂芳基和杂芳基-C₁-C₄-烷基,

[0203] R³代表氢或C₁-C₆-烷基,

[0204] R⁴代表选自如下的基团: 氢、C₁-C₄-烷基、卤代-C₁-C₄-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、C₂-

C₄-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基羰基、C₁-C₄-烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基、芳基、芳基-C₁-C₄-烷基和杂芳基-C₁-C₄-烷基,

[0205] R⁵代表选自如下的基团:氢、C₁-C₄-烷基、卤代-C₁-C₄-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基羰基、C₁-C₄-烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基、芳基、芳基-C₁-C₄-烷基和杂芳基-C₁-C₄-烷基,或者

[0206] R³和R⁴与它们所连接的氮原子一起形成4至7元环,所述4至7元环可含有一个或两个选自氮、氧和硫(其中氧原子和硫原子不能彼此直接相邻)的其他杂原子,

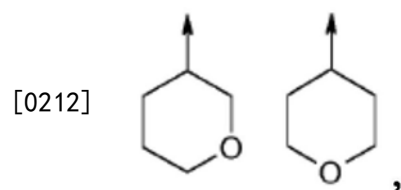
[0207] R⁶代表氢或C₁-C₄-烷基,

[0208] R⁷代表选自如下的基团:氢、C₁-C₄-烷基、卤代-C₁-C₄-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₄-环烷基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、卤代-C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基羰基、C₁-C₄-烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基、芳基、芳基-C₁-C₄-烷基或杂芳基-C₁-C₄-烷基,或者

[0209] R⁶和R⁷与它们所连接的氮原子一起形成4至7元环,所述4至7元环可含有一个或两个选自氮、氧和硫(其中氧原子和硫原子不能彼此直接相邻)的其他杂原子,

[0210] R⁸代表选自如下的基团:氢、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、氰基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₂-C₆-烯基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基,各自任选地被卤素取代的C₁-C₆-烷基羰基和C₁-C₆-烷基磺酰基,任选地被卤素取代的C₁-C₆-烷氧基羰基,任选地被卤素、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷基和氰基取代的C₃-C₆-环烷基羰基,或者代表阳离子或任选地被C₁-C₆-烷基或芳基-C₁-C₆-烷基取代的铵离子,

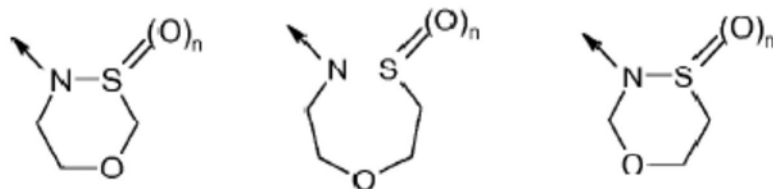
[0211] R⁹代表选自如下的基团:各自任选地被卤素、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷硫基、C₁-C₆-卤代烷硫基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基和C₁-C₆-卤代烷基磺酰基取代的C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基和C₂-C₆-炔基;各自任选地被卤素、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基或C₁-C₆-卤代烷氧基取代的C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₆-烷基和C₃-C₆-环烯基,其中一个环成员可被选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子代替(并且,此处特别地代表



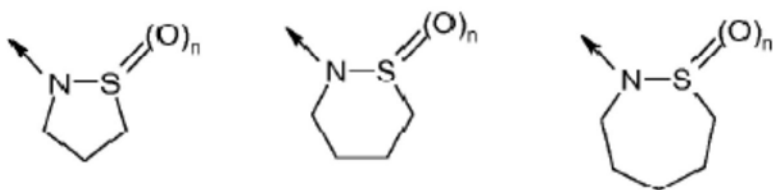
[0213] 其中箭头各自表示与基团(C-1)和基团(F-1)中的硫原子连接的键);各自任选地被卤素、氰基(以及在烷基部分中的)、硝基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷硫基、C₁-C₆-卤代烷硫基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基、氨基、C₁-C₆-烷基氨基、二-(C₁-C₆-烷基)-氨基、C₁-C₆-烷基羰基氨基、C₁-C₆-烷氧基羰基氨基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基或氨基羰基取代的芳基、杂芳基、芳基-C₁-C₆-烷基、杂芳基-C₁-C₆-烷基;或代表NR'R'',其中R'和R''彼此独立地代表选自氢、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代

烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷基羰基和C₁-C₆-烷氧基羰基的基团,或者

[0214] 基团 (C-1) 和基团 (F-1) 中的R⁸和R⁹还可与它们所连接的N-S(O)_n基团一起形成饱和或不饱和的且任选地被卤素、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基取代的5至7元环,所述5至7元环可含有一个或两个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子和/或至少一个且优选一个羰基,特别地,R⁸和R⁹可与它们所连接的N-S(O)_n基团一起代表选自如下的基团



[0215]



[0216] (其中箭头各自表示与C(X)基团连接的键),

[0217] R¹⁵代表选自如下的基团:各自任选地被甲基、氰基、氨基甲酰基取代的C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基和C₂-C₆-炔基;各自任选地被甲基、三氟甲基、卤素、氰基或氨基甲酰基取代的C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₂-烷基和C₃-C₆-环烯基,其中所述环可含有至少一个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子;各自任选地被C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷硫基、C₁-C₄-卤代烷硫基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、C₁-C₄-烷基氨基、二-(C₁-C₄-烷基)-氨基、卤素、硝基或氰基取代的芳基、杂芳基、芳基-C₁-C₄-烷基和杂芳基-C₁-C₂-烷基;以及任选地被C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基羰基、C₁-C₄-烷基-C₁-C₄-烷氧基羰基-或C₁-C₄-烷基磺酰基取代的氨基,

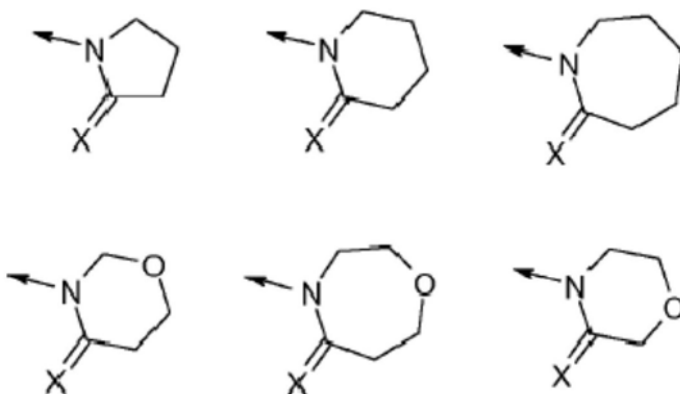
[0218] 基团 (C-6) 中R⁸和R¹⁵还可与它们所连接的N-S(O)_n基团一起形成饱和或不饱和的且任选取代的4至8元环,所述4至8元环可含有一个或两个选自硫、氧(其中氧原子和硫原子不能彼此直接相邻)和氮的其他杂原子和/或至少一个羰基,

[0219] R¹⁶代表选自如下的基团:氢;各自任选地被甲基、氰基、氨基甲酰基或羧基取代的C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₄-烯基和C₂-C₄-炔基;各自任选地被卤素、氰基、硝基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷硫基、C₁-C₆-卤代烷硫基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基、氨基、C₁-C₆-烷基氨基、二-(C₁-C₆-烷基)氨基、C₁-C₆-烷基羰基氨基、C₁-C₆-烷氧基羰基氨基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基-或C₁-C₆-烷基羰基取代的C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基和C₃-C₆-环烯基,其中所述环可含有至少一个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子;各自任选地被卤素、氰基、硝基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷硫基、C₁-C₆-卤代烷硫基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基、氨基、C₁-C₆-烷基氨基、二-(C₁-C₆-烷基)氨基、C₁-C₆-烷基羰基氨基、C₁-C₆-烷氧基羰基氨基、

C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基-或C₁-C₆-烷基羰基取代的芳基、杂芳基、芳基-C₁-C₂-烷基和杂芳基-C₁-C₂-烷基；以及任选地被C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷基硫基、C₁-C₆-卤代烷基硫基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基或C₁-C₆-烷基羰基取代的氨基，

[0220] R¹⁷代表选自如下的基团：各自任选地被卤素、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷基硫基、C₁-C₆-卤代烷基硫基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基或C₁-C₆-卤代烷基磺酰基取代的C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆-烯基和C₂-C₆-炔基，各自任选地被卤素、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基-或C₁-C₆-卤代烷氧基取代的C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₆-烷基和C₃-C₆-环烯基、N-吡咯烷基、N-哌啶基、N-吗啉基、N-硫代吗啉基、N-硫代吗啉基1-氧化物、N-硫代吗啉基1,1-二氧化物、N-哌嗪基、N-1-甲基哌嗪基或N-2-氧代-1-甲基哌嗪基，各自任选地被卤素、氰基（以及在烷基部分中的）、硝基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷基硫基、C₁-C₆-卤代烷基硫基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基、氨基、C₁-C₆-烷基氨基、二（C₁-C₆-烷基）氨基、C₁-C₆-烷基羰基氨基、C₁-C₆-烷氧基羰基氨基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基或氨基羰基取代的芳基、杂芳基、芳基-C₁-C₆-烷基、杂芳基-C₁-C₆-烷基，或者代表NR'R''，其中R'和R''彼此独立地各自代表选自如下的基团：氢、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷基羰基和C₁-C₆-烷氧基羰基，

[0221] 基团 (C-8) 和基团 (F-8) 中的R⁸和R¹⁷还可与它们所连接的N-C (X) 基团一起形成饱和或不饱和的且任选地被卤素、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基取代的5至7元环，所述5至7元环可含有一个或两个选自硫、氧（其中氧原子不能彼此直接相邻）和氮的其他杂原子和/或一个羰基，特别地，R⁸和R¹⁷可与它们所连接的N-C (X) 基团一起代表选自如下的基团



[0222]

[0223] （其中箭头各自表示与基团 (C-8) 和基团 (F-8) 中的硫原子连接的键），

[0224] R¹⁸代表选自如下的基团：氢，羟基，各自任选被卤素单取代或多取代的或被氰基单取代或二取代的C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₆-烷基-S-C₁-C₄-烷基、C₁-C₆-烷基-S(O)-C₁-C₄-烷基、C₁-C₆-烷基-S(O)₂-C₁-C₄-烷基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烯基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₃-烷基、C₃-C₆-环烯基-C₁-C₃-

烷基、杂环基、杂环基-C₁-C₃-烷基,以及各自任选被C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、卤素或氰基单取代至四取代的苯基、苯基-C₁-C₃-烷基、杂芳基和杂芳基-C₁-C₃-烷基,

[0225] R¹⁹代表氢,碱金属离子或碱土金属离子,或代表任选被C₁-C₄-烷基单取代至四取代的铵离子,或代表各自任选被卤素单取代或多取代的或被氰基单取代或二取代的C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基-S-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基-S(O)-C₁-C₄-烷基和C₁-C₄-烷基-S(O)₂-C₁-C₄-烷基,

[0226] Y³代表选自如下的基团:氢、卤素、氰基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基和NR²⁰R²¹,

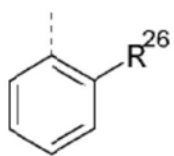
[0227] W代表选自如下的基团:O、S、SO和SO₂,

[0228] R²²代表选自如下的基团:C₁-C₆-烷基,任选地被卤素、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基或氰基取代的C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₄-烷基硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基硫基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、C₁-C₄-烷基硫基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基硫基-C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基-C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基磺酰基-C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基硫基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基硫基-C₂-C₄-烯基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基-C₂-C₄-烯基、C₁-C₄-烷基磺酰基-C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-烯基硫基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基亚磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₄-烷基)氨基磺酰基,

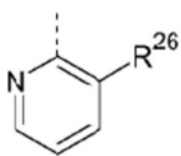
[0229] 在R²=d的情况下,

[0230] R²²还代表任选地被下列基团取代的芳基:卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-烯氧基、C₃-C₆-炔氧基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷氧基羰基氧基、C₁-C₆-烷基氨基、C₃-C₆-烯基氨基、C₃-C₆-炔基氨基、C₃-C₆-环烷基氨基、C₁-C₆-烷基硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₃-C₆-烯基硫基、C₃-C₆-炔基硫基、C₃-C₆-环烷基硫基、C₁-C₄-卤代烷基硫基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、C₁-C₆-烷基羰基、氨基羰基、C₁-C₆-烷基氨基羰基、二-(C₁-C₆-烷基)-氨基羰基、C₁-C₆-烷基羰基氨基、C₁-C₆-烷基氨基或二-(C₁-C₆-烷基)-氨基,或代表选自E-1至E-51的基团

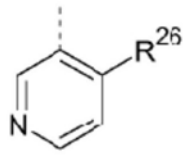
[0231]



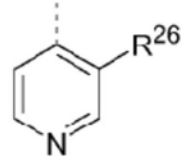
E-1



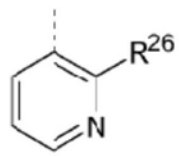
E-2



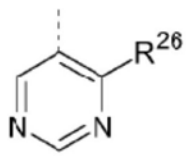
E-3



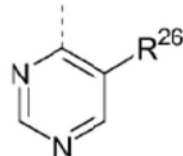
E-4



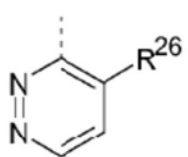
E-5



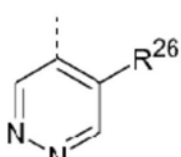
E-6



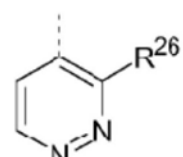
E-7



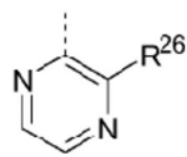
E-8



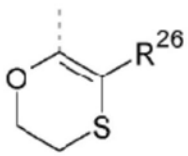
E-9



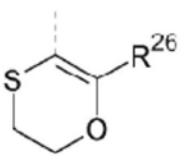
E-10



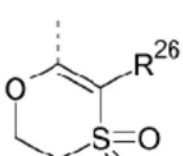
E-11



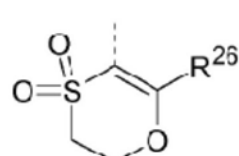
E-12



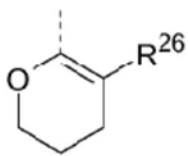
E-13



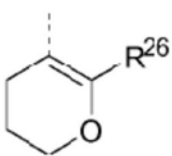
E-14



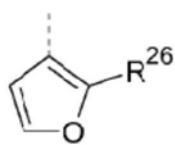
E-15



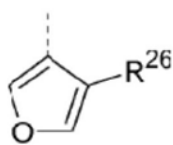
E-16



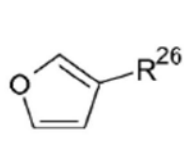
E-17



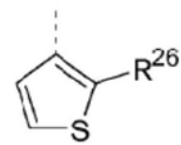
E-18



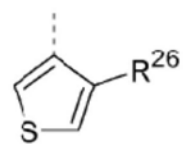
E-19



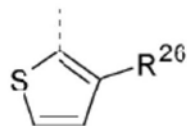
E-20



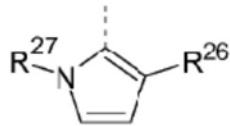
E-21



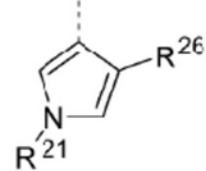
E-22



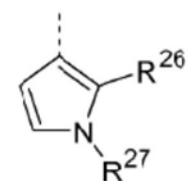
E-23



E-24

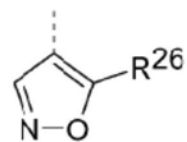


E-25

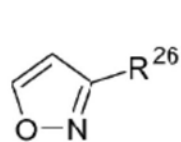


E-26

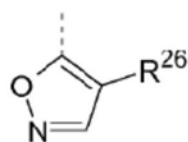
[0232]



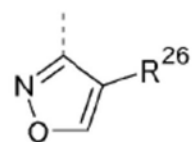
E-27



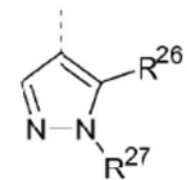
E-28



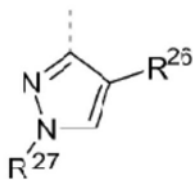
E-29



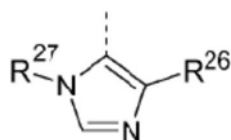
E-30



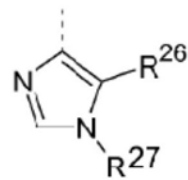
E-31



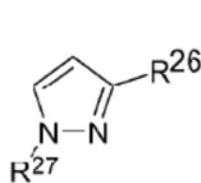
E-32



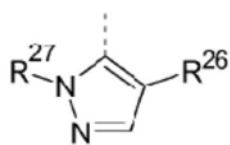
E-33



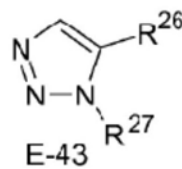
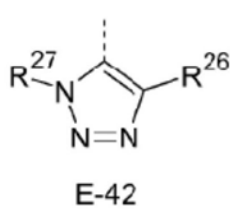
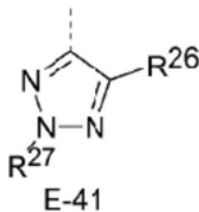
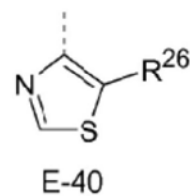
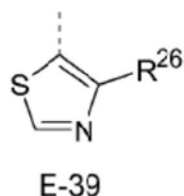
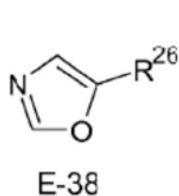
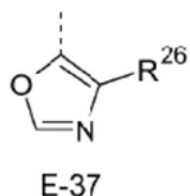
E-34



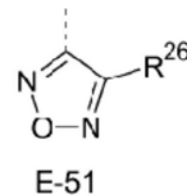
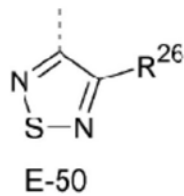
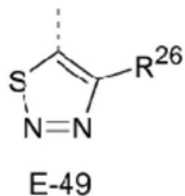
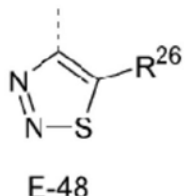
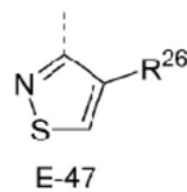
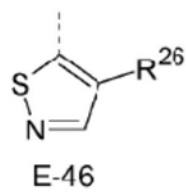
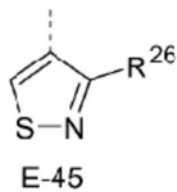
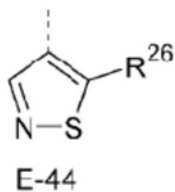
E-35



E-36



[0233]



[0234] R^{20} 代表选自如下的基团:氢、卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、氰基- C_1 - C_6 -烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -卤代烷氧基、 C_3 - C_6 -烯氧基、 C_3 - C_6 -炔氧基、 C_3 - C_6 -环烷氧基、 C_1 - C_6 -烷基羰基氧基、 C_2 - C_6 -烯基羰基氧基、 C_2 - C_6 -炔基羰基氧基、 C_3 - C_6 -环烷基羰基氧基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基氧基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基氧基、 C_1 - C_6 -烷基氨基、 C_3 - C_6 -烯基氨基、 C_3 - C_6 -炔基氨基、 C_3 - C_6 -环烷基氨基、 C_1 - C_6 -烷硫基、 C_1 - C_6 -卤代烷硫基、 C_3 - C_6 -烯硫基、 C_3 - C_6 -炔硫基、 C_3 - C_6 -环烷硫基、 C_1 - C_6 -烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -烷氧基亚氨基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基、氨基羰基、 C_1 - C_6 -烷基氨基羰基、二- $(C_1$ - C_6 -)-烷基氨基羰基、氨基硫代羰基、 C_1 - C_6 -烷基氨基磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基氨基、 C_1 - C_6 -烷基羰基氨基、 C_1 - C_6 -烷硫基羰基氨基,以及各自任选被选自卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、 C_1 - C_6 -烷基和 C_1 - C_6 -卤代烷基的基团取代的苯基、苯氧基、吡啶基和吡啶氧基,

[0235] R^{21} 代表选自如下的基团:氢、 C_1 - C_6 -烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_3 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_6 -烷基、氰基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_2 - C_6 -烯基羰基、 C_1 - C_6 -卤代烷基羰基、 C_2 - C_6 -卤代烯基羰基、 C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基和 C_1 - C_6 -卤代烷基磺酰基,

[0236] R^{23} 代表选自如下的基团:氢、 C_1 - C_6 -烷基、 C_2 - C_4 -烯基、 C_2 - C_4 -炔基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_3 - C_6 -环烯基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_2 - C_6 -烯氧基、 C_2 - C_6 -炔氧基、 C_3 - C_6 -环烷氧基、 C_1 - C_4 -烷硫基- C_1 - C_4 -烷基、 C_2 - C_4 -烯硫基- C_1 - C_4 -烷基、氰基- C_1 - C_4 -烷基和 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基,

[0237] R^{24} 代表氢,或代表各自任选地被卤素或氰基取代的下列基团: C_1 - C_4 -烷基、 C_2 - C_6 -

烯基、C₂-C₆-炔基、苯基和苯基-C₁-C₂-烷基，

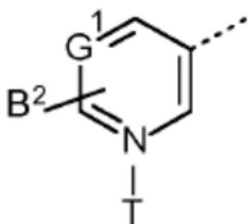
[0238] R²⁵代表氢，或代表各自任选地被卤素或氰基取代的下列基团：C₁-C₄-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、苯基和苯基-C₁-C₂-烷基，

[0239] R²⁷代表氢或C₁-C₄-烷基，且

[0240] R²⁶代表氢、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₂-烷基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₂-烷基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基-C₁-C₂-烷基、C₁-C₄-烷基磺酰基-C₁-C₂-烷基和氰基-C₁-C₄-烷基，

[0241] 以及下列式 (I) 的化合物，其中

[0242] A代表A基团



[0243]

(A-a)

[0244] 其中虚线代表与式 (I) 的双环的氮原子连接的键，且

[0245] G¹代表N或C-B¹，

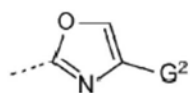
[0246] B¹代表选自氢、卤素、C₁-C₆-烷基和C₁-C₄-卤代烷基的基团，

[0247] B²代表选自氢、卤素、C₁-C₆-烷基和C₁-C₄-卤代烷基的基团，

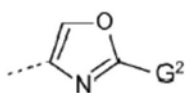
[0248] T代表氧或电子对，

[0249] R¹代表选自氢、C₁-C₆-烷基和C₁-C₆-烷氧基的基团，

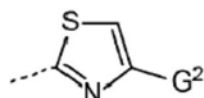
[0250] R^{2a}) 代表选自如下的B基团



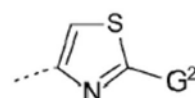
(B-5)



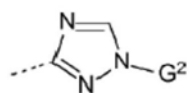
(B-6)



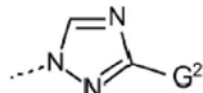
(B-7)



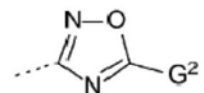
(B-8)



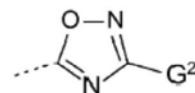
(B-9)



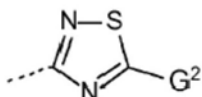
(B-10)



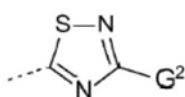
(B-11)



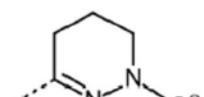
(B-12)



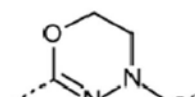
(B-13)



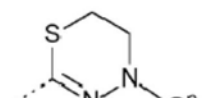
(B-14)



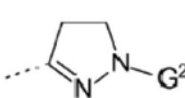
(B-15)



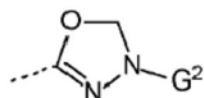
(B-16)



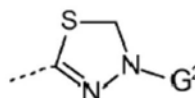
(B-17)



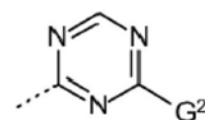
(B-18)



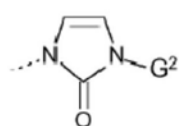
(B-19)



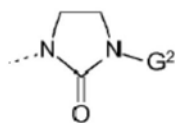
(B-20)



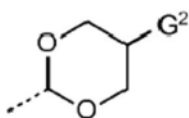
(B-28)



(B-29)



(B-30)



(B-34)

[0251]

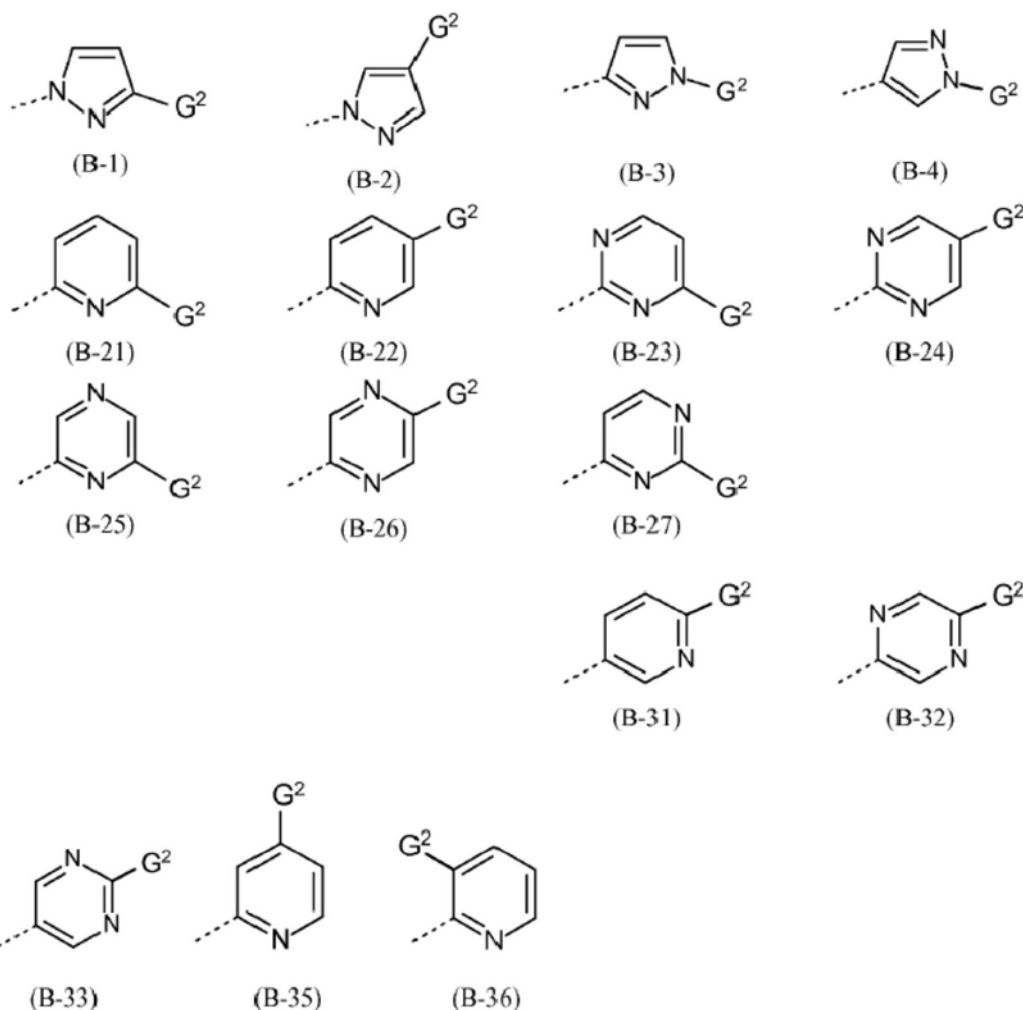
[0253] 其中虚线代表与式(I)的双环的碳原子连接的键,

[0254] 其中

[0255] G^2 代表氢或代表选自如下的基团:卤素、硝基、氨基、氰基、 C_1 - C_4 -烷基氨基、卤代- C_1 - C_4 -烷基氨基、 C_1 - C_4 -二烷基氨基、 C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_4 -环烯基、 C_1 - C_4 -环烷基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、卤代- C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、二(C_1 - C_4 -烷氧基)- C_1 - C_4 -烷基、二(卤代- C_1 - C_4 -烷氧基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基-(C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基-(C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基-(C_1 - C_4 -烷基磺酰基)- C_1 - C_4 -烷基、二(C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、二(卤代- C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、二(羟基- C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基- C_1 - C_4 -烷基、 α -羟基亚氨基- C_1 - C_4 -烷氧基羰基- C_1 - C_4 -烷基、 α - C_1 - C_4 -烷氧基亚氨基- C_1 - C_4 -烷氧基羰基- C_1 - C_4 -烷基、 $C(X^2)$

NR³R⁴、NR⁶R⁷、C₁-C₄-烷基硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基硫基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基, 杂环基基团: 二氧杂环己基、二氧杂环戊基、二氧杂环庚基、二氧杂环辛基、氧硫杂环己基、氧硫杂环戊基、氧硫杂环庚基、氧硫杂环辛基、二硫杂环己基、二硫杂环戊基、二硫杂环庚基、二硫杂环辛基、氧硫杂环己基氧化物、氧硫杂环戊基氧化物、氧硫杂环庚基氧化物、氧硫杂环辛基氧化物、氧硫杂环己基二氧化物、氧硫杂环戊基二氧化物、氧硫杂环庚基二氧化物、氧硫杂环辛基二氧化物、吗啉基、三唑啉酮基、噁唑啉基、二氢噁二嗪基、二氢二噁嗪基、二氢噁唑基、二氢噁嗪基和吡唑啉酮基(其本身可被C₁-C₄-烷基、卤代-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基取代), 苯基(其本身可被卤素、氰基、硝基、C₁-C₄-烷基和卤代-C₁-C₄-烷基取代), 杂芳基基团: 吡啶基、吡啶基N-氧化物、嘧啶基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、噻唑基、呋喃基、噻吩基、三唑基、四唑基、噁二唑基、噻二唑基、吡嗪基、三嗪基、四嗪基和异喹啉基(其本身可被卤素、硝基、C₁-C₄-烷基、卤代-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、卤代-C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基硫基、C₁-C₄-烷基硫基-C₁-C₄-烷基和C₃-C₆-环烷基取代), 以及杂芳基-C₁-C₄-烷基基团: 三唑基-C₁-C₄-烷基、吡啶基-C₁-C₄-烷基、嘧啶基-C₁-C₄-烷基和噁二唑基-C₁-C₄-烷基(其本身可被卤素和C₁-C₄-烷基取代), 或者

[0256] R^{2aa}) 代表以下B基团之一

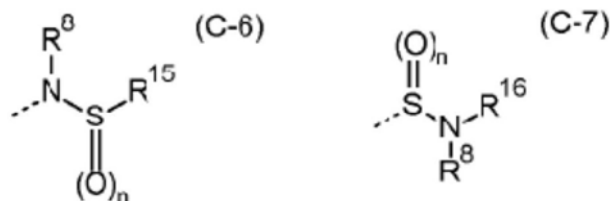


[0258] 其中虚线代表与式(I)的双环的碳原子连接的键, 其中

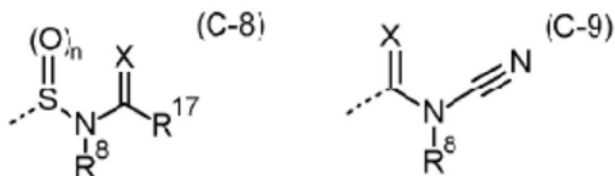
[0259] G^2 代表选自如下的基团:卤素、硝基、氨基、氰基、 C_1 - C_4 -烷基氨基、卤代- C_1 - C_4 -烷基氨基、 C_1 - C_4 -二烷基氨基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_3 - C_6 -环烯基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、二(C_1 - C_4 -烷氧基)- C_1 - C_4 -烷基、二(卤代- C_1 - C_4 -烷氧基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基-(C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基-(C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基-(C_1 - C_4 -烷基磺酰基)- C_1 - C_4 -烷基、二(C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、二(卤代- C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、二(羟基- C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基- C_1 - C_4 -烷基、 α -羟基亚氨基- C_1 - C_4 -烷氧基羰基- C_1 - C_4 -烷基、 α - C_1 - C_4 -烷氧基亚氨基- C_1 - C_4 -烷氧基羰基- C_1 - C_4 -烷基、 $C(X^2)NR^3R^4$ 、 NR^6R^7 、 C_1 - C_4 -烷基硫基、 C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 -烷基磺酰基、 C_1 - C_4 -卤代烷基硫基、 C_1 - C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 -卤代烷基磺酰基,杂环基基团:二氧杂环己基、二氧杂环戊基、二氧杂环庚基、二氧杂环辛基、氧硫杂环己基、氧硫杂环戊基、氧硫杂环庚基、氧硫杂环辛基、二硫杂环己基、二硫杂环戊基、二硫杂环庚基、二硫杂环辛基、氧硫杂环己基氧化物、氧硫杂环戊基氧化物、氧硫杂环庚基氧化物、氧硫杂环辛基氧化物、氧硫杂环己基二氧化物、氧硫杂环戊基二氧化物、氧硫杂环庚基二氧化物、氧硫杂环辛基二氧化物、吗啉基、三唑啉酮基、噁唑啉基、二氢噁二嗪基、二氢二噁嗪基、二氢噁唑基、二氢噁嗪基和吡唑啉酮基(其本身可被 C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基和 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基取代),苯基(其本身可被卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 -烷基和卤代- C_1 - C_4 -烷基取代),杂芳基基团:咪唑基、吡唑基、噁唑基、呋喃基、噻吩基、三唑基、四唑基、噁二唑基、吡嗪基、三嗪基、四嗪基和异噻啉基(其本身可被卤素、硝基、 C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、卤代- C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷基硫基、 C_1 - C_4 -烷基硫基- C_1 - C_4 -烷基和 C_3 - C_6 -环烷基取代),以及杂芳基- C_1 - C_4 -烷基基团:三唑基- C_1 - C_4 -烷基、吡啶基- C_1 - C_4 -烷基、嘧啶基- C_1 - C_4 -烷基和噁二唑基- C_1 - C_4 -烷基(其本身可被卤素和 C_1 - C_4 -烷基取代),或者

[0260] 如果 R^2 代表a)或aa)下所列基团之一,则

[0261] G^2 还代表选自如下的C基团

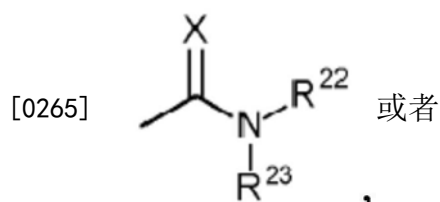


[0262]

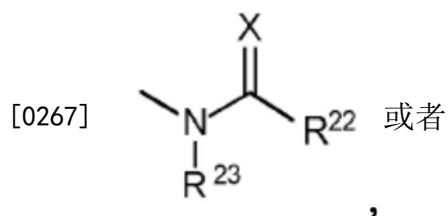


[0263] 其中虚线代表与B基团连接的键,或者

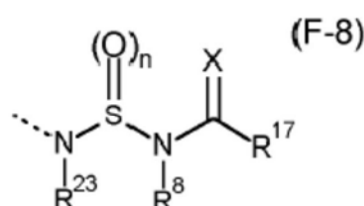
[0264] $R^2c)$ 代表下式的基团



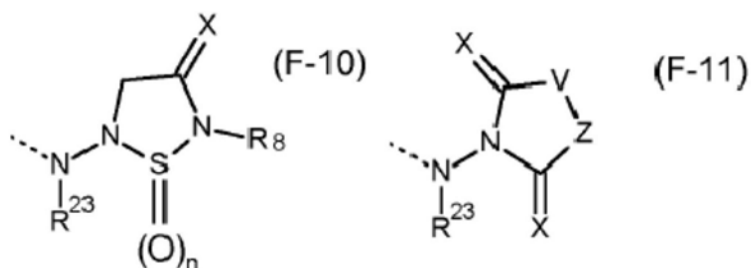
[0266] R^{2d}) 代表下式的基团



[0268] R^{2e}) 代表选自如下的F基团



[0269]



[0270] 其中虚线代表与式(I)中的碳原子连接的键,或者

[0271] R^{2f}) 代表选自C₁-C₆-卤代烷基、羧基和氨基的基团,

[0272] X代表氧或硫,

[0273] X²代表氧、硫、NR⁵或NOH,

[0274] V-Z代表R²⁴CH-CHR²⁵或R²⁴C=CR²⁵,

[0275] n代表1或2,

[0276] R³代表氢或C₁-C₆-烷基,

[0277] R⁴代表选自如下的基团:氢、C₁-C₄-烷基、卤代-C₁-C₄-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基羰基、C₁-C₄-烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基、芳基、芳基-C₁-C₄-烷基和杂芳基-C₁-C₄-烷基,

[0278] R⁵代表选自如下的基团:氢、C₁-C₄-烷基、卤代-C₁-C₄-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基羰基、C₁-C₄-烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基、芳基、芳基-C₁-C₄-烷基和杂芳基-C₁-C₄-烷基,或者

[0279] R³和R⁴与它们所连接的氮原子一起形成4至7元环,所述4至7元环可含有一个或两

个选自氮、氧和硫(其中氧原子和硫原子不能彼此直接相邻)的其他杂原子,

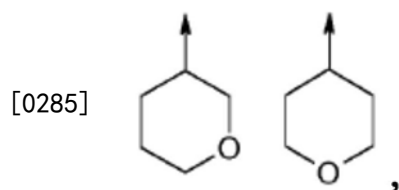
[0280] R^6 代表氢或 C_1-C_4 -烷基,

[0281] R^7 代表选自如下的基团:氢、 C_1-C_4 -烷基、卤代- C_1-C_4 -烷基、氰基- C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -炔基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_3-C_4 -环烷基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、卤代- C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷硫基- C_1-C_4 -烷基、芳基、芳基- C_1-C_4 -烷基或杂芳基- C_1-C_4 -烷基,或者

[0282] R^6 和 R^7 与它们所连接的氮原子一起形成4至7元环,所述4至7元环可含有一个或两个选自氮、氧和硫(其中氧原子和硫原子不能彼此直接相邻)的其他杂原子,

[0283] R^8 代表选自如下的基团:氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、氰基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、 C_2-C_6 -烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基,各自任选地被卤素取代的 C_1-C_6 -烷基羰基和 C_1-C_6 -烷基磺酰基,任选地被卤素取代的 C_1-C_6 -烷氧基羰基,任选地被卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷基和氰基取代的 C_3-C_6 -环烷基羰基,或者代表阳离子或任选地被 C_1-C_6 -烷基或芳基- C_1-C_6 -烷基取代的铵离子,

[0284] R^9 代表选自如下的基团:各自任选地被卤素、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、 C_1-C_6 -烷硫基、 C_1-C_6 -卤代烷硫基、 C_1-C_6 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 -烷基磺酰基和 C_1-C_6 -卤代烷基磺酰基取代的 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基和 C_2-C_6 -炔基;各自任选地被卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基或 C_1-C_6 -卤代烷氧基取代的 C_3-C_6 -环烷基、 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_6 -烷基和 C_3-C_6 -环烯基,其中一个环成员可被选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子代替(并且,此处特别地代表



[0286] 其中箭头各自表示与基团(C-1)和基团(F-1)中的硫原子连接的键);各自任选地被卤素、氰基(以及在烷基部分中的)、硝基、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、 C_1-C_6 -烷硫基、 C_1-C_6 -卤代烷硫基、 C_1-C_6 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 -烷基磺酰基、 C_1-C_6 -卤代烷基磺酰基、氨基、 C_1-C_6 -烷基氨基、二-(C_1-C_6 -烷基)氨基、 C_1-C_6 -烷基羰基氨基、 C_1-C_6 -烷氧基羰基氨基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基- C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷基羰基、 C_1-C_6 -烷氧基羰基或氨基羰基取代的芳基、杂芳基、芳基- C_1-C_6 -烷基、杂芳基- C_1-C_6 -烷基;或代表 $NR'R''$,其中 R' 和 R'' 彼此独立地代表选自氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -烷基羰基和 C_1-C_6 -烷氧基羰基的基团,或者

[0287] R^{15} 代表选自如下的基团:各自任选地被甲基、氰基、氨基甲酰基取代的 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基和 C_2-C_6 -炔基;各自任选地被甲基、三氟甲基、卤素、氰基或氨基甲酰基取代的 C_3-C_6 -环烷基、 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_2 -烷基和 C_3-C_6 -环烯基,其中所述环可含有至少一个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子;各自任选地被 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -卤代烷硫基、 C_1-C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基、 C_1-C_4 -烷基氨基、二-(C_1-C_4 -烷基)-氨基、卤素、硝基或氰基取代的芳基、杂芳基、芳基- C_1-C_4 -烷基和杂芳基- C_1-C_2 -烷基;以及任选地被 C_1-C_4 -烷

基、C₁-C₄-烷基羰基、C₁-C₄-烷基-C₁-C₄-烷氧基羰基或C₁-C₄-烷基磺酰基取代的氨基，

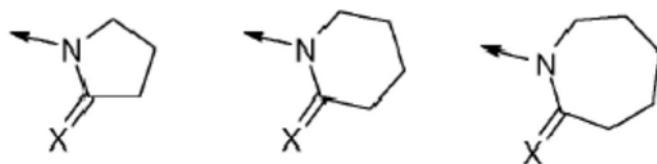
[0288] 基团 (C-6) 中R⁸和R¹⁵还可与它们所连接的N-S(O)_n基团一起形成饱和或不饱和的且任选取代的4至8元环，所述4至8元环可含有一个或两个选自硫、氧(其中氧原子和硫原子不能彼此直接相邻)和氮的其他杂原子和/或至少一个羰基，

[0289] R¹⁶代表选自如下的基团：氢；各自任选地被甲基、氰基、氨基甲酰基或羧基取代的C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₄-烯基和C₂-C₄-炔基；各自任选地被卤素、氰基、硝基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷硫基、C₁-C₆-卤代烷硫基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基、氨基、C₁-C₆-烷基氨基、二(C₁-C₆-烷基)氨基、C₁-C₆-烷基羰基氨基、C₁-C₆-烷氧基羰基氨基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基或C₁-C₆-烷基羰基取代的C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基和C₃-C₆-环烯基，其中所述环可含有至少一个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子；各自任选地被卤素、氰基、硝基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷硫基、C₁-C₆-卤代烷硫基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基、氨基、C₁-C₆-烷基氨基、二(C₁-C₆-烷基)氨基、C₁-C₆-烷基羰基氨基、C₁-C₆-烷氧基羰基氨基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基或C₁-C₆-烷基羰基取代的芳基、杂芳基、芳基-C₁-C₂-烷基和杂芳基-C₁-C₂-烷基；以及任选地被C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷硫基、C₁-C₆-卤代烷硫基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基或C₁-C₆-烷基羰基取代的氨基，

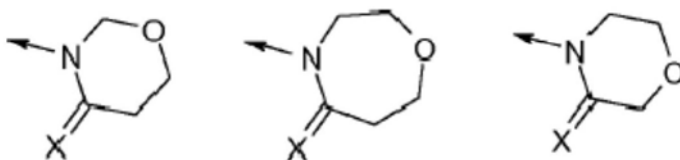
[0290] R¹⁷代表选自如下的基团：各自任选地被卤素、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷硫基、C₁-C₆-卤代烷硫基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基或C₁-C₆-卤代烷基磺酰基取代的C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆-烯基和C₂-C₆-炔基，各自任选地被卤素、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基或C₁-C₆-卤代烷氧基取代的C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₆-烷基和C₃-C₆-环烯基、N-吡咯烷基、N-哌啶基、N-吗啉基、N-硫代吗啉基、N-硫代吗啉基1-氧化物、N-硫代吗啉基1,1-二氧化物、N-哌嗪基、N-1-甲基哌嗪基或N-2-氧代-1-甲基哌嗪基，各自任选地被卤素、氰基(以及在烷基部分中的)、硝基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷硫基、C₁-C₆-卤代烷硫基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基、氨基、C₁-C₆-烷基氨基、二(C₁-C₆-烷基)氨基、C₁-C₆-烷基羰基氨基、C₁-C₆-烷氧基羰基氨基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基或氨基羰基取代的芳基、杂芳基、芳基-C₁-C₆-烷基、杂芳基-C₁-C₆-烷基，或者代表NR'R''，其中R'和R''彼此独立地各自代表选自如下的基团：氢、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷基羰基和C₁-C₆-烷氧基羰基，

[0291] 基团 (C-8) 和基团 (F-8) 中的R⁸和R¹⁷还可与它们所连接的N-C(X)基团一起形成饱和或不饱和的且任选地被卤素、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基取代的5至7元环，所述5至7元环可含有一个或两个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的其他杂原子和/或一个羰基，特别地，R⁸和R¹⁷可与它们所连接的N-C(X)基团一

起代表选自如下的基团



[0292]

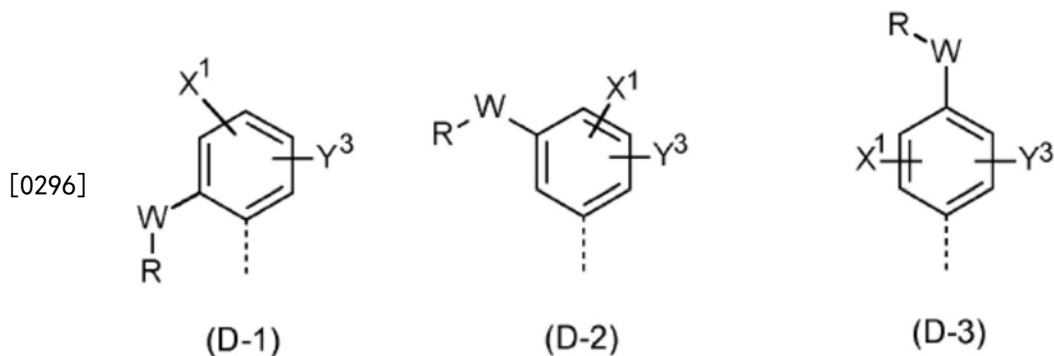


(其中箭头各自表示与基团 (C-8) 和基团 (F-8) 中的硫原子连接的键),

[0293] R^{18} 代表选自如下的基团: 氢, 羟基, 各自任选被卤素单取代或多取代的或被氰基单取代或二取代的 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基-S- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基-S(O)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基-S(O)₂- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_3 - C_6 -环烯基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_3 -烷基、 C_3 - C_6 -环烯基- C_1 - C_3 -烷基、杂环基、杂环基- C_1 - C_3 -烷基, 以及各自任选被 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 C_3 - C_6 -环烷基、卤素或氰基单取代至四取代的苯基、苯基- C_1 - C_3 -烷基、杂芳基和杂芳基- C_1 - C_3 -烷基,

[0294] R^{19} 代表氢, 碱金属离子或碱土金属离子, 或代表任选被 C_1 - C_4 -烷基单取代至四取代的铵离子, 或代表各自任选被卤素单取代或多取代的或被氰基单取代或二取代的 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷基-S- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷基-S(O)- C_1 - C_4 -烷基和 C_1 - C_4 -烷基-S(O)₂- C_1 - C_4 -烷基,

[0295] R^{22} 代表选自 (D-1) 至 (D-3) 的基团



[0297] 其中虚线代表与基团 c) 中的氮原子或与基团 d) 中的碳原子连接的键,

[0298] X^1 代表选自如下的基团: 氢、卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基和 C_1 - C_6 -卤代烷氧基,

[0299] R 代表 $NR^{18}R^{19}$, 或代表下述基团: 各自任选被卤素、氧 (得到 $C=O$) 或氰基取代的 C_1 - C_6 -烷基、 C_3 - C_6 -烯基、 C_3 - C_6 -炔基、 C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基-S- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基-S(O)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基-S(O)₂- C_1 - C_4 -烷基, R^{18} -CO- C_1 - C_4 -烷基, $NR^{18}R^{19}$ -CO- C_1 - C_4 -烷基, 任选被氧 (得到 $C=O$)、 C_1 - C_4 -烷基、 C_3 - C_8 -环烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基和 C_1 - C_4 -卤代烷基单取代或二取代的 C_3 - C_6 -环烷基, 任选被氧 (得到 $C=O$)、 C_1 - C_4 -烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_4 -

烷氧基和C₁-C₄-卤代烷基单取代或二取代的C₃-C₈-环烯基,任选被氧(得到C=O)、C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷基单取代或二取代的C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基,任选被氧(得到C=O)、C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷基单取代或二取代的C₃-C₆-环烯基-C₁-C₄-烷基,任选被氧(得到C=O)、C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷基单取代或二取代的杂环基,任选被氧(得到C=O)、C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷基单取代或二取代的杂环基-C₁-C₄-烷基,或各自任选被卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基或C₁-C₄-卤代烷氧基单取代至三取代的苯基、苯基-C₁-C₄-烷基、杂芳基和杂芳基-C₁-C₄-烷基,

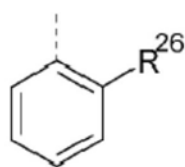
[0300] Y³代表选自如下的基团:氢、卤素、氰基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基和NR²⁰R²¹,

[0301] W代表选自如下的基团:S、SO和SO₂,

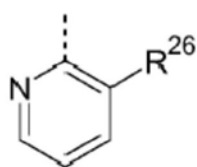
[0302] 或者

[0303] R²²代表选自如下的E基团

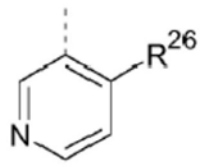
[0304]



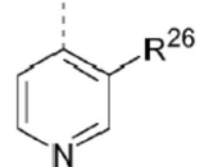
E-1



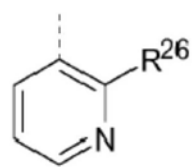
E-2



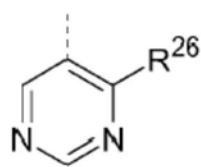
E-3



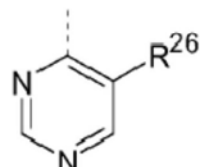
E-4



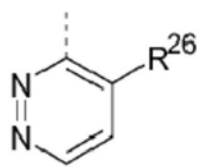
E-5



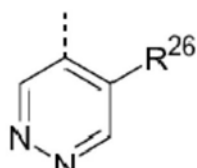
E-6



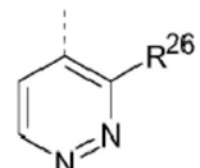
E-7



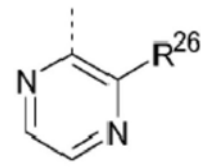
E-8



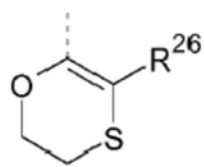
E-9



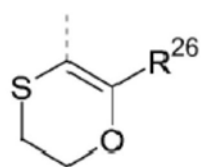
E-10



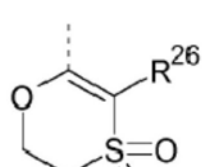
E-11



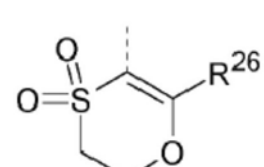
E-12



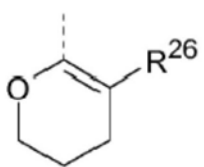
E-13



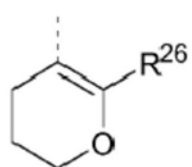
E-14



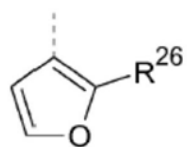
E-15



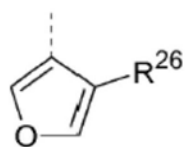
E-16



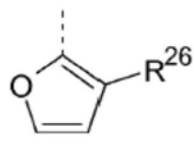
E-17



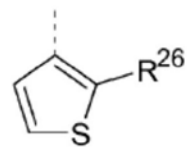
E-18



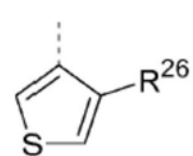
E-19



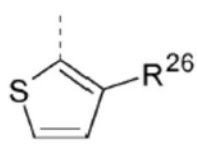
E-20



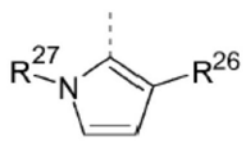
E-21



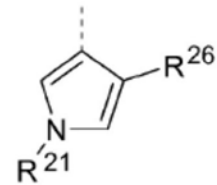
E-22



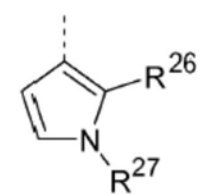
E-23



E-24

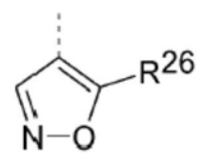


E-25

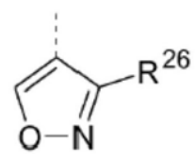


E-26

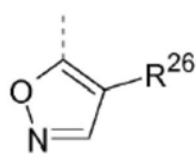
[0305]



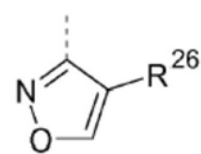
E-27



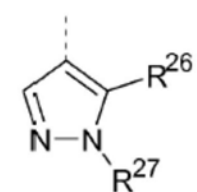
E-28



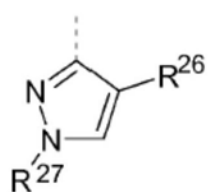
E-29



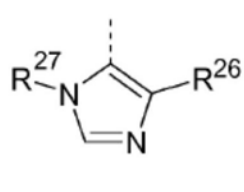
E-30



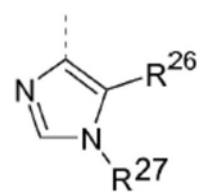
E-31



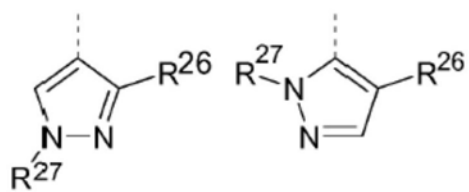
E-32



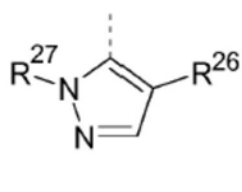
E-33



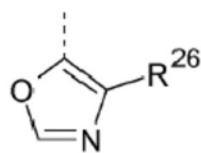
E-34



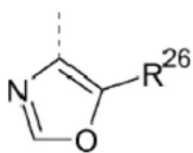
E-35



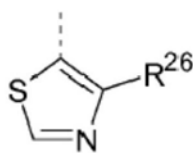
E-36



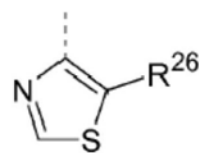
E-37



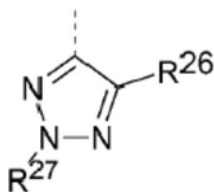
E-38



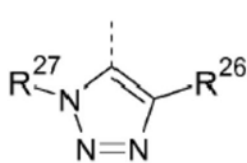
E-39



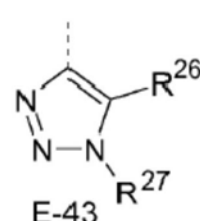
E-40



E-41

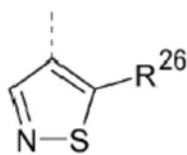


E-42

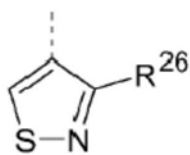


E-43

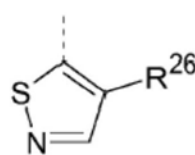
[0306]



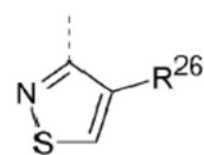
E-44



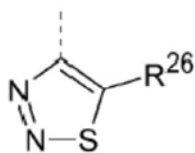
E-45



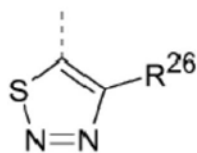
E-46



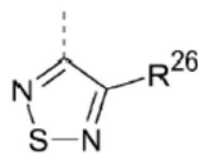
E-47



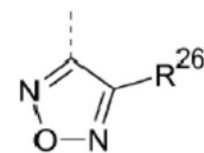
E-48



E-49



E-50



E-51

[0307] R^{20} 代表选自如下的基团:氢、卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、氰基- C_1 - C_6 -烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -卤代烷氧基、 C_3 - C_6 -烯氧基、 C_3 - C_6 -炔氧基、 C_3 - C_6 -环烷氧基、 C_1 - C_6 -烷基羰基氧基、 C_2 - C_6 -烯基羰基氧基、 C_2 - C_6 -炔基羰基氧基、 C_3 - C_6 -环烷基羰基氧基、 C_1 - C_6 -烷基羰基氧基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基氧基、 C_1 - C_6 -烷基氨基、 C_3 - C_6 -烯基氨基、 C_3 - C_6 -炔基氨基、 C_3 - C_6 -环烷基氨基、 C_1 - C_6 -烷硫基、 C_1 - C_6 -卤代烷硫基、 C_3 - C_6 -烯硫基、 C_3 - C_6 -炔硫基、 C_3 - C_6 -环烷硫基、 C_1 - C_6 -烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -烷氧基亚氨基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基、氨基羰基、 C_1 - C_6 -烷基氨基羰基、二-(C_1 - C_6 -)-烷基氨基羰基、氨基硫代羰基、 C_1 - C_6 -烷基氨基磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基氨基、 C_1 - C_6 -烷基羰基氨基、 C_1 - C_6 -烷硫基羰基氨基,以及各自任选被选自卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、 C_1 - C_6 -烷基和 C_1 - C_6 -卤代烷基的基团取代的苯基、苯氧基、吡啶基和吡啶氧基,

[0308] R^{21} 代表选自如下的基团:氢、 C_1 - C_6 -烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_3 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_6 -烷基、氰基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷基羰基、 C_2 - C_6 -烯基羰基、 C_1 - C_6 -卤代烷基羰基、 C_2 - C_6 -卤代烯基羰基、 C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基和 C_1 - C_6 -卤代烷基磺酰基,

[0309] R^{23} 代表选自如下的基团:氢、 C_1 - C_6 -烷基、 C_2 - C_4 -烯基、 C_2 - C_4 -炔基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_3 - C_6 -环烯基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_2 - C_6 -烯氧基、 C_2 - C_6 -炔氧基、 C_3 - C_6 -环烷氧基、 C_1 - C_4 -烷硫基- C_1 - C_4 -烷基、 C_2 - C_4 -烯硫基- C_1 - C_4 -烷基、氰基- C_1 - C_4 -烷基和 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基,

[0310] R^{24} 代表氢,或代表各自任选地被卤素或氰基取代的下列基团: C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、苯基和苯基- C_1-C_2 -烷基,

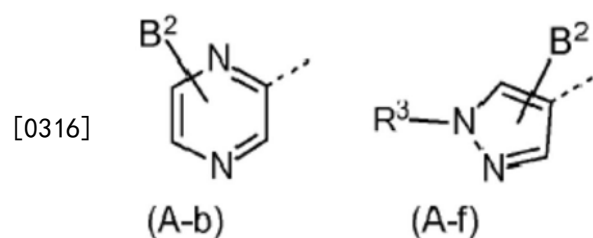
[0311] R^{25} 代表氢,或代表各自任选地被卤素或氰基取代的下列基团: C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、苯基和苯基- C_1-C_2 -烷基,

[0312] R^{27} 代表氢或 C_1-C_4 -烷基,且

[0313] R^{26} 代表氢、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_2-C_4 -炔基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_4 -烷硫基- C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基- C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基- C_1-C_2 -烷基或氰基- C_1-C_4 -烷基。

[0314] 优选范围(2):特别优选下列式(I)的化合物,其中

[0315] A代表选自如下的A基团



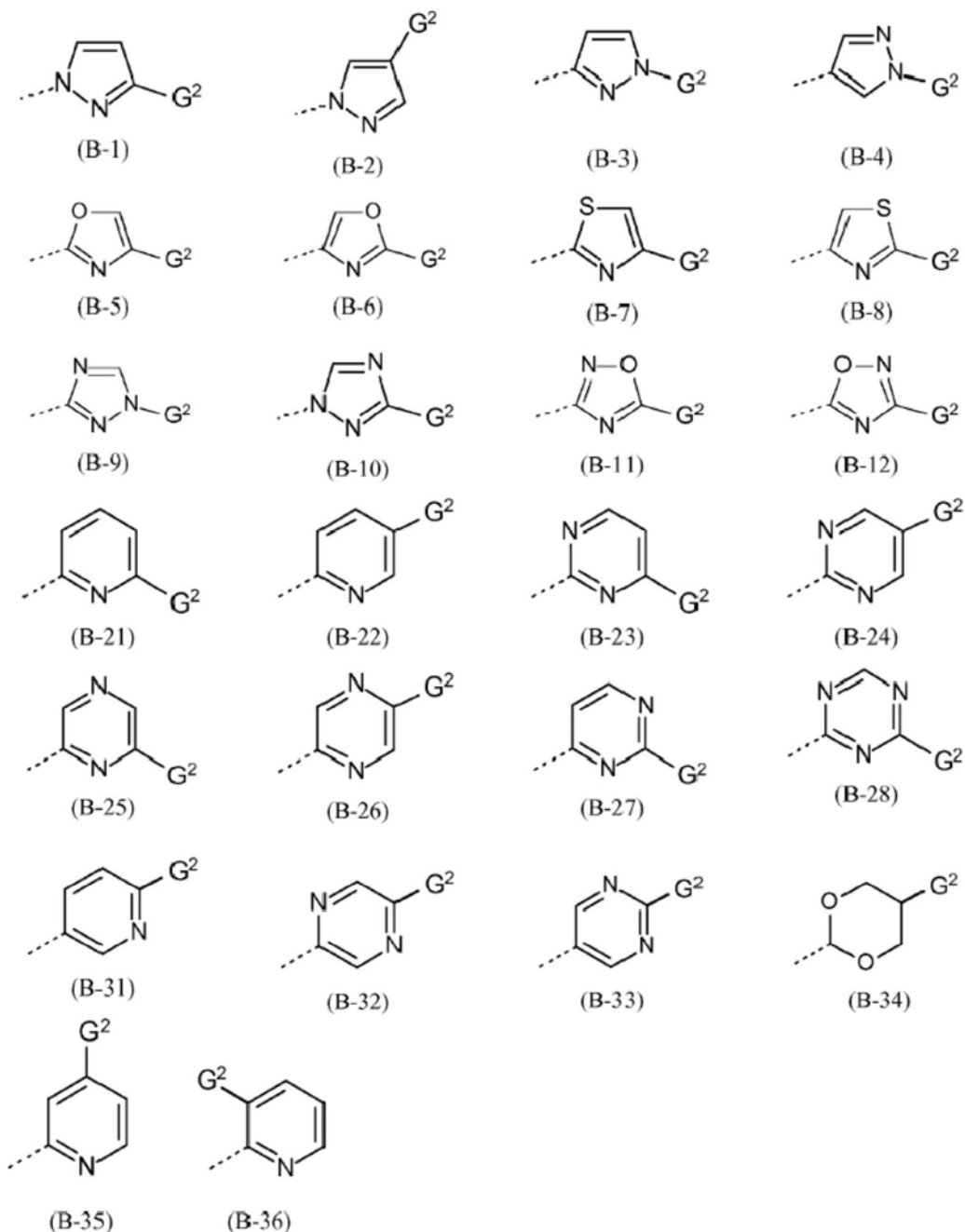
[0317] 其中虚线代表与式(I)的双环的氮原子连接的键,

[0318] B^2 代表选自氢、卤素、 C_1-C_6 -烷基和 C_1-C_4 -卤代烷基的基团,

[0319] R^1 代表选自氢、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基的基团,

[0320] $R^{2a)}$ 代表选自如下的B基团

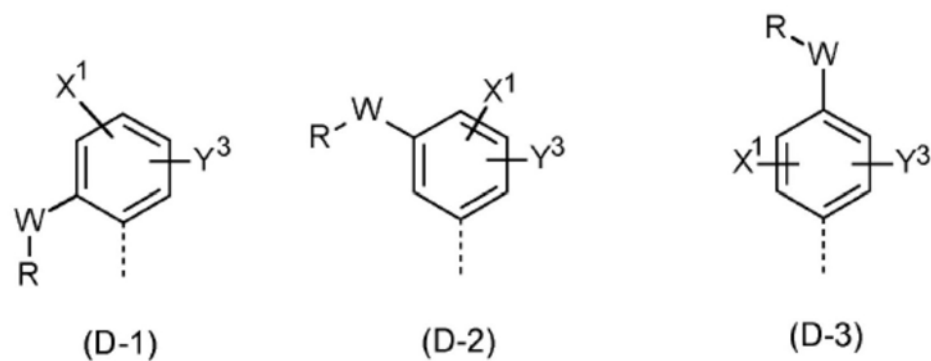
[0321]



[0322] 其中虚线代表与式 (I) 的双环的碳原子连接的键, 或者

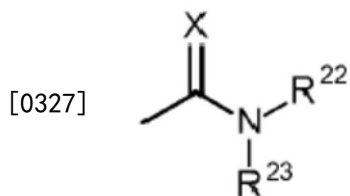
[0323] R^2b 代表选自 (D-1) 至 (D-3) 的基团

[0324]



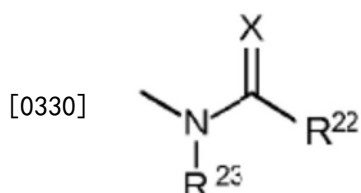
[0325] 其中虚线代表与式 (I) 的双环的碳原子连接的键, 或者

[0326] R^{2c}) 代表下式的基团



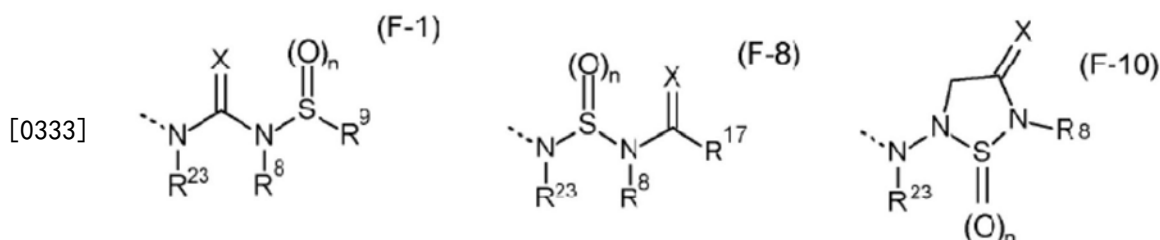
[0328] 或者

[0329] R^{2d}) 代表下式的基团



[0331] 或者

[0332] R^{2e}) 代表选自 (F-1)、(F-8) 和 (F-10) 的F基团



[0334] 其中虚线代表与式 (I) 中的碳原子连接的键, 或者

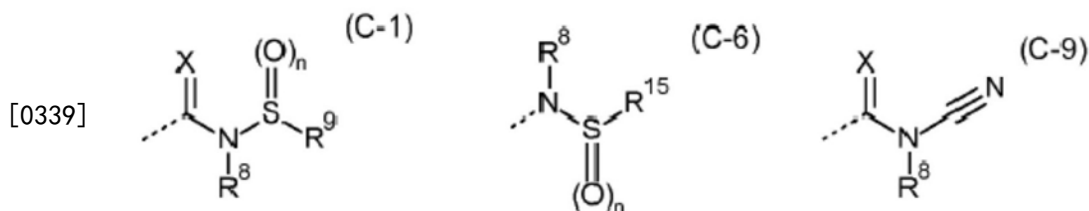
[0335] R^{2f}) 代表选自如下的基团: C_1 - C_6 -卤代烷基、羧基和氨基, 其中

[0336] G^2 代表氢或选自如下的基团: 卤素、硝基、氨基、氰基、 C_1 - C_4 -烷基氨基、卤代- C_1 - C_4 -烷基氨基、二- (C_1 - C_4 -烷基)-氨基、 C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、卤代- C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、二 (C_1 - C_4 -烷氧基)- C_1 - C_4 -烷基、二 (卤代- C_1 - C_4 -烷氧基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- (C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- (C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- (C_1 - C_4 -烷基磺酰基)- C_1 - C_4 -烷基、二 (C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、二 (卤代- C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、二 (羟基- C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基- C_1 - C_4 -烷基、 $C(X^2)NR^3R^4$ 、 NR^6R^7 、 C_1 - C_4 -烷硫基、 C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 -烷基磺酰基、 C_1 - C_4 -卤代烷硫基、 C_1 - C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 -卤代烷基磺酰基, 杂环基团: 二氧杂环己基、二氧杂环戊基、二氧杂环庚基、二氧杂环辛基、氧硫杂环己基、氧硫杂环戊基、氧硫杂环庚基、氧硫杂环辛基、二硫杂环己基、二硫杂环戊基、二硫杂环庚基、二硫杂环辛基、氧硫杂环己基氧化物、氧硫杂环戊基氧化物、氧硫杂环庚基氧化物、氧硫杂环辛基氧化物、氧硫杂环己基二氧化物、氧硫杂环戊基二氧化物、氧硫杂环庚基二氧化物、氧硫杂环辛基二氧化物、吗啉基、三唑啉酮基、噁唑啉基、二氢噁二嗪基、二氢二噁嗪基、二氢噁唑基、二氢噁嗪基和吡唑啉酮基 (其本身可被 C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基和 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基取代), 苯基 (其本身可被卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_4 -烷基和卤代- C_1 - C_4 -烷基取代), 杂芳基基团: 吡啶基、吡啶基N-氧化物、嘧啶基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、噻唑基、呋喃基、噻吩

基、三唑基、四唑基、噁二唑基、噻二唑基、吡嗪基、三嗪基、四嗪基和异喹啉基(其本身可被卤素、硝基、 C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、卤代- C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷硫基、 C_1 - C_4 -烷硫基- C_1 - C_4 -烷基和 C_3 - C_6 -环- C_1 - C_4 -烷基取代),以及杂芳基- C_1 - C_4 -烷基基团:三唑基- C_1 - C_4 -烷基、吡啶基- C_1 - C_4 -烷基、嘧啶基- C_1 - C_4 -烷基和噁二唑基- C_1 - C_4 -烷基(其本身可被卤素和 C_1 - C_4 -烷基取代),

[0337] 或者

[0338] G^2 代表选自(C-1)、(C-6)和(C-9)的基团



[0340] 其中虚线代表与B基团连接的键,

[0341] X代表氧,

[0342] X^1 代表选自如下的基团:氢、氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基和 C_1 - C_4 -卤代烷氧基,

[0343] X^2 代表氧、硫、 NR^5 或NOH,

[0344] n代表2,

[0345] R代表 $NR^{18}R^{19}$,或代表下述基团:各自任选被卤素单取代至七取代的、被氧(得到 $C=O$)单取代或二取代的或者被氰基单取代或二取代的 C_1 - C_6 -烷基、 C_3 - C_6 -烯基、 C_3 - C_6 -炔基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_4 -烷基-S- C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_4 -烷基-S(O)- C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_4 -烷基-S(O)₂- C_1 - C_3 -烷基、 R^{18} -CO- C_1 - C_2 -烷基、 $NR^{18}R^{19}$ -CO- C_1 - C_2 -烷基,任选被氧(得到 $C=O$)、 C_1 - C_4 -烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基和 C_1 - C_4 -卤代烷基单取代或二取代的 C_3 - C_6 -环烷基,任选被氧(得到 $C=O$)、 C_1 - C_4 -烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基和 C_1 - C_4 -卤代烷基单取代或二取代的 C_3 - C_8 -环烯基,任选被氧(得到 $C=O$)、 C_1 - C_4 -烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基和 C_1 - C_4 -卤代烷基单取代或二取代的 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_4 -烷基,任选被氧(得到 $C=O$)、 C_1 - C_4 -烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基和 C_1 - C_4 -卤代烷基单取代或二取代的 C_3 - C_6 -环烯基- C_1 - C_4 -烷基,任选被氧(得到 $C=O$)、 C_1 - C_4 -烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基和 C_1 - C_4 -卤代烷基单取代或二取代的杂环基,任选被氧(得到 $C=O$)、 C_1 - C_4 -烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基和 C_1 - C_4 -卤代烷基单取代或二取代的杂环基- C_1 - C_4 -烷基,或各自任选被卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基或 C_1 - C_4 -卤代烷氧基单取代至三取代的苯基、苯基- C_1 - C_4 -烷基、杂芳基和杂芳基- C_1 - C_4 -烷基,

[0346] R^3 代表 C_1 - C_4 -烷基,

[0347] R^4 代表选自如下的基团:氢、 C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷基、氰基- C_1 - C_4 -烷基、 C_2 - C_4 -炔基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基- C_1 - C_4 -烷基和 C_1 - C_4 -烷硫基- C_1 - C_4 -烷基,

[0348] R^5 代表选自如下的基团:氢、 C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷基、氰基- C_1 - C_4 -烷基、 C_2 - C_4 -炔基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基- C_1 - C_4 -烷基和 C_1 - C_4 -烷硫基- C_1 - C_4 -烷基,

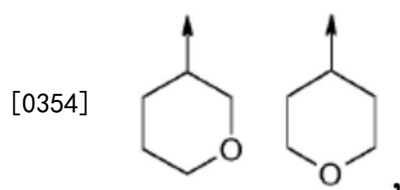
[0349] R^6 代表氢或 C_1-C_4 -烷基,

[0350] R^7 代表选自如下的基团:氢、 C_1-C_4 -烷基、卤代- C_1-C_4 -烷基、氰基- C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -炔基、 C_1-C_4 -烷氧基、卤代- C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷硫基- C_1-C_4 -烷基、芳基- C_1-C_4 -烷基或杂芳基- C_1-C_4 -烷基,或者

[0351] R^6 和 R^7 与它们所连接的氮原子一起形成4至7元环,所述4至7元环可含有一个或两个选自氮、氧和硫(其中氧原子和硫原子不能彼此直接相邻)的其他杂原子,

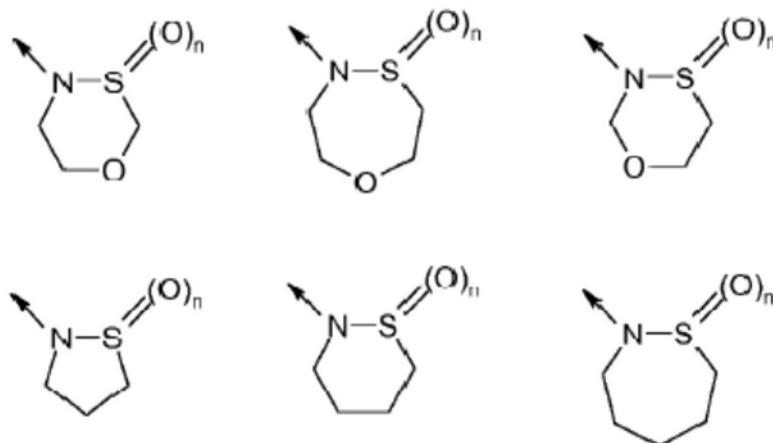
[0352] R^8 代表选自如下的基团:氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、氰基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、 C_2-C_6 -烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基,各自任选地被卤素取代的 C_1-C_6 -烷基羰基和 C_1-C_6 -烷基磺酰基,任选地被卤素取代的 C_1-C_6 -烷氧基羰基,以及任选地被卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷基和氰基取代的 C_3-C_6 -环烷基羰基,或者代表阳离子或任选地被 C_1-C_6 -烷基或芳基- C_1-C_6 -烷基取代的铵离子,

[0353] R^9 代表选自如下的基团:各自任选地被卤素、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -卤代烷硫基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基和 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基取代的 C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -烯基和 C_2-C_4 -炔基;各自任选地被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -卤代烷氧基取代的 C_3-C_6 -环烷基、 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_4 -烷基和 C_3-C_4 -环烯基,其中一个或两个环成员可各自被选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子代替(并且,此处特别地代表



[0355] 其中箭头各自表示与基团(C-1)和基团(F-1)中的硫原子连接的键);各自任选地被卤素、氰基(以及在烷基部分中的)、硝基、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -卤代烷硫基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基、氨基、 C_1-C_4 -烷基氨基、二(C_1-C_4 -烷基)氨基、 C_1-C_4 -烷基羰基氨基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基氨基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_2-C_4 -炔基、 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基羰基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基或氨基羰基取代的芳基、杂芳基、芳基- C_1-C_4 -烷基和杂芳基- C_1-C_4 -烷基;或代表 $NR'R''$,其中 R' 和 R'' 彼此独立地代表选自氢和 C_1-C_4 -烷基的基团,或者

[0356] 基团(C-1)和基团(F-1)中的 R^8 和 R^9 还可与它们所连接的 $N-S(O)_n$ 基团一起形成饱和或不饱和的且任选地被卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基取代的5至7元环,所述5至7元环可含有一个或两个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子和/或至少一个且优选恰好一个羰基,特别地, R^8 和 R^9 可与它们所连接的 $N-S(O)_n$ 基团一起代表选自如下的基团



[0357]

[0358] (其中箭头各自表示与C(X)基团连接的键),

[0359] R^{15} 代表选自如下的基团:各自任选地被甲基取代的 C_1 - C_6 -烷基、 C_2 - C_6 -烯基和 C_2 - C_6 -炔基,各自任选地被甲基、卤素、氰基或氨基甲酰基取代的 C_3 - C_6 -环烷基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_2 -烷基和 C_3 - C_6 -环烯基,

[0360] 基团(C-6)中 R^8 和 R^{15} 还可与它们所连接的N-S(O) $_n$ 基团一起形成饱和或不饱和的且任选取代的4至8元环,所述4至8元环可含有一个或两个选自硫、氧(其中氧原子和硫原子不能彼此直接相邻)和氮的其他杂原子和/或至少一个羰基,

[0361] R^{17} 代表选自如下的基团:各自任选地被卤素、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 C_1 - C_4 -烷硫基、 C_1 - C_4 -卤代烷硫基、 C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 -烷基磺酰基和 C_1 - C_4 -卤代烷基磺酰基取代的 C_1 - C_4 -烷基、 C_2 - C_4 -烯基和 C_2 - C_4 -炔基,各自任选地被卤素、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -卤代烷氧基取代的 C_3 - C_6 -环烷基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_4 -烷基和 C_3 - C_4 -环烯基、N-吡咯烷基、N-哌啶基、N-吗啉基、N-硫代吗啉基、N-硫代吗啉基1-氧化物、N-硫代吗啉基1,1-二氧化物、N-哌嗪基、N-1-甲基哌嗪基或N-2-氧代-1-甲基哌嗪基,各自任选地被卤素、氰基(以及在烷基部分中的)、硝基、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 C_1 - C_4 -烷硫基、 C_1 - C_4 -卤代烷硫基、 C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 -烷基磺酰基、 C_1 - C_4 -卤代烷基磺酰基、氨基、 C_1 - C_4 -烷基氨基、二(C_1 - C_4 -烷基)氨基、 C_1 - C_4 -烷基羰基氨基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基氨基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -卤代烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_2 - C_4 -烯基、 C_2 - C_4 -炔基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷基羰基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基或氨基羰基取代的芳基、杂芳基、芳基- C_1 - C_4 -烷基和杂芳基- C_1 - C_4 -烷基,或者代表 $NR'R''$,其中 R' 和 R'' 彼此独立地代表选自氢和 C_1 - C_4 -烷基的基团,

[0362] R^{18} 代表选自如下的基团:氢,羟基,各自任选被卤素单取代或多取代的或被氰基单取代或二取代的 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷基-S- C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_4 -烷基-S(O)- C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_4 -烷基-S(O) $_2$ - C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_4 -烷基羰基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_3 -烷基、杂环基、杂环基- C_1 - C_3 -烷基,以及各自任选被 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_3 -卤代烷基、 C_1 - C_3 -烷氧基、 C_1 - C_3 -卤代烷氧基、环丙基、氟、氯、溴或氰基单取代至三取代的苯基、苄基、吡啶基、嘧啶基、噻唑基、噁唑基、吡唑基、噻吩基、呋喃基、吡啶基甲基和噻唑基甲基,

[0363] R^{19} 代表氢,代表碱金属离子或碱土金属离子,或代表任选被 C_1 - C_4 -烷基单取代至

四取代的铵离子,或代表各自任选被卤素单取代或多取代的或被氰基单取代或二取代的选自C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₂-烷基、C₁-C₄-烷基-S-C₁-C₂-烷基、C₁-C₄-烷基-S(O)-C₁-C₂-烷基和C₁-C₄-烷基-S(O)₂-C₁-C₂-烷基的基团,

[0364] Y³代表选自如下的基团:氢、氟、氯、溴、碘、氰基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷氧基,

[0365] W代表选自如下的基团:S、SO和SO₂,

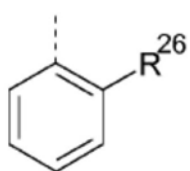
[0366] R²²如果R²代表基团c),则R²²代表选自如下的基团:C₁-C₆-烷基,任选地被卤素、氨基甲酰基、硫代氨基甲酰基或氰基取代的C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₄-烷硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-卤代烷硫基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基-C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基磺酰基-C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷硫基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷硫基-C₂-C₄-烯基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基-C₂-C₄-烯基、C₁-C₄-烷基磺酰基-C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-烯硫基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基亚磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₄-烷基)-氨基磺酰基,

[0367] R²³如果R²代表基团c),则R²³代表选自如下的基团:氢、C₁-C₆-烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯硫基-C₁-C₄-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基,

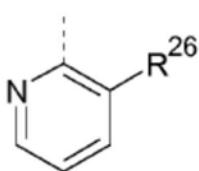
[0368] R²³如果R²代表基团d),则R²³代表选自如下的基团:氢、C₁-C₆-烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烯基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆-烯氧基、C₂-C₆-炔氧基、C₃-C₆-环烷氧基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯硫基-C₁-C₄-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基,

[0369] 或者,在R²=d)的情况下,

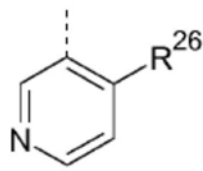
[0370] R²²还代表任选地被卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₆-烷氧基羰基氧基、C₁-C₆-烷基氨基、C₁-C₆-烷硫基、C₁-C₄-卤代烷硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₆-烷基羰基、氨基羰基、C₁-C₆-烷基氨基羰基、二-(C₁-C₆-烷基)氨基羰基、C₁-C₆-烷基羰基氨基取代的苯基,或代表选自如下的E基团



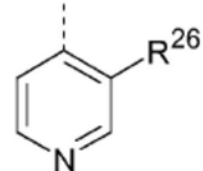
E-1



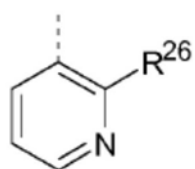
E-2



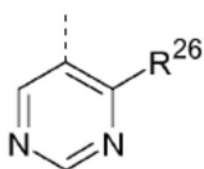
E-3



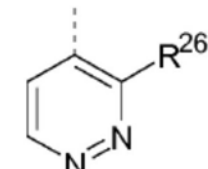
E-4



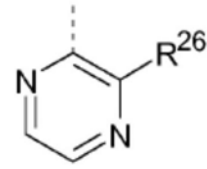
E-5



E-6

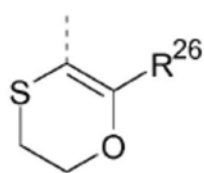


E-10

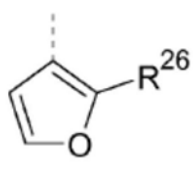


E-11

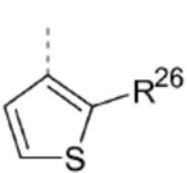
[0371]



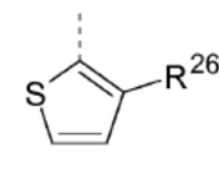
E-13



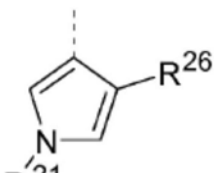
E-18



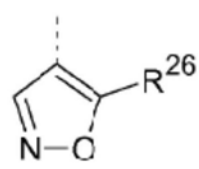
E-21



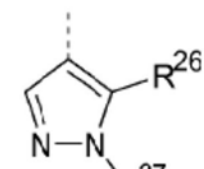
E-23



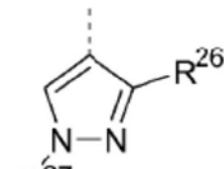
E-25



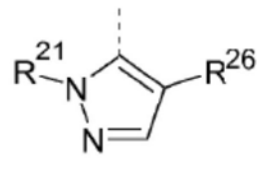
E-27



E-31

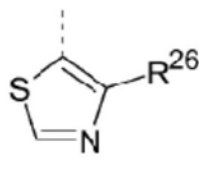


E-35

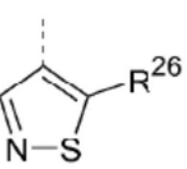


E-36

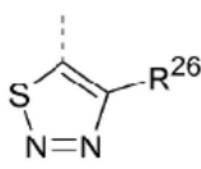
[0372]



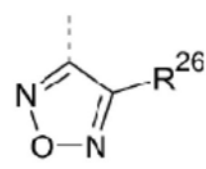
E-39



E-44



E-49



E-51

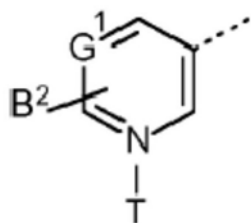
[0373] R^{27} 代表氢或 C_1-C_4 -烷基,且

[0374] R^{26} 代表氢、 C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_2-C_4 -炔基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_4 -烷硫基- C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基- C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基- C_1-C_2 -烷基和氰基- C_1-C_4 -烷基,以及

[0375] 下列式(I)的化合物,其中

[0376] A代表A基团

[0377]

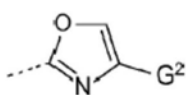


(A-a)

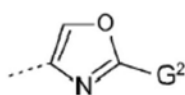
[0378] 其中虚线代表与式 (I) 的双环的氮原子连接的键,

[0379] G^1 代表 N 或 $C-B^1$,[0380] B^1 代表选自氢、卤素、 C_1-C_6 -烷基和 C_1-C_4 -卤代烷基的基团,[0381] B^2 代表选自氢、卤素、 C_1-C_6 -烷基和 C_1-C_4 -卤代烷基的基团,

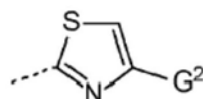
[0382] T 代表氧或电子对,

[0383] R^1 代表选自氢、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基的基团,[0384] $R^2a)$ 代表选自如下的 B 基团

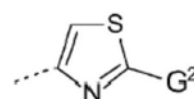
(B-5)



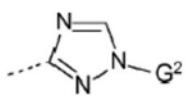
(B-6)



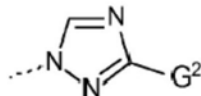
(B-7)



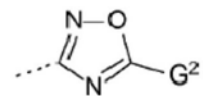
(B-8)



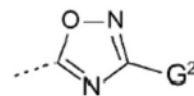
(B-9)



(B-10)

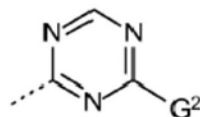


(B-11)

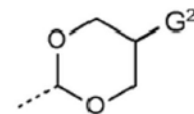


(B-12)

[0385]



(B-28)

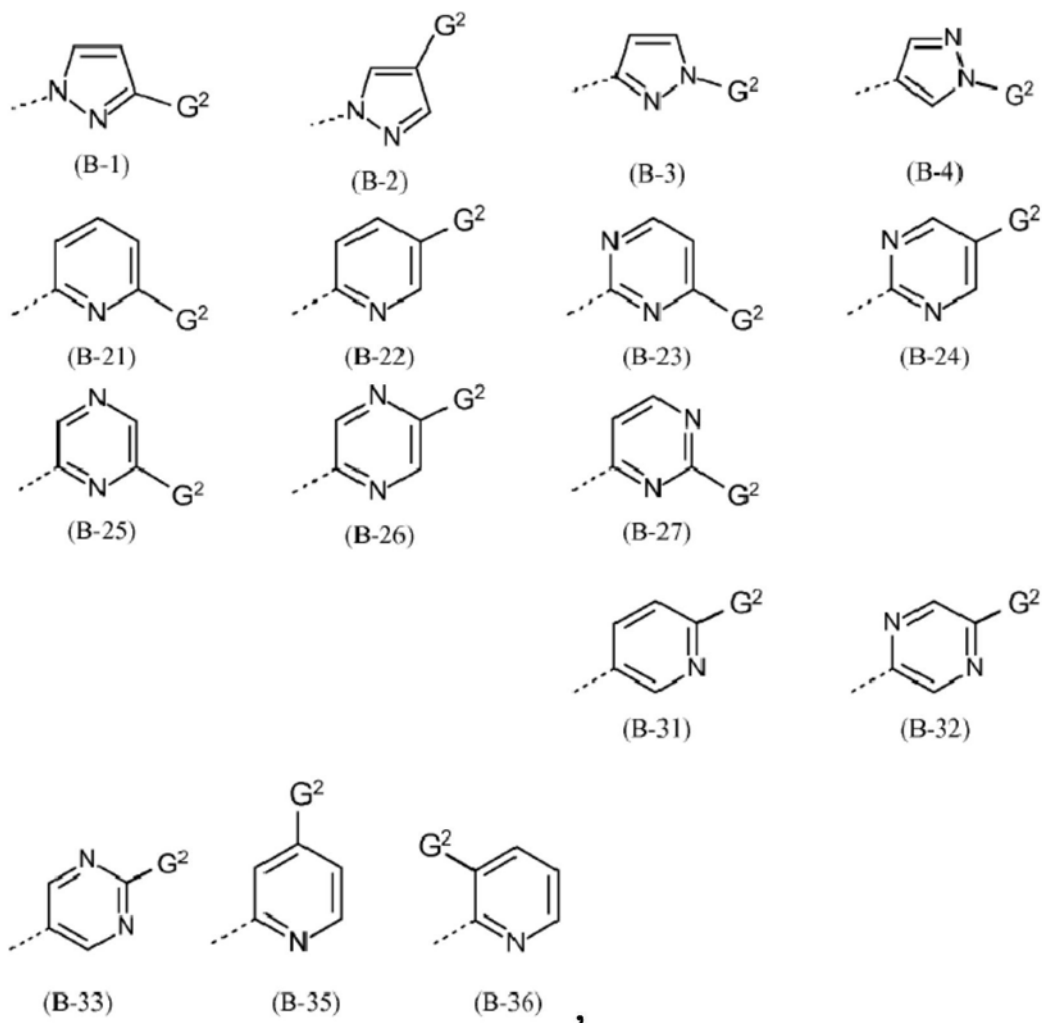


[0386] 其中虚线代表与式 (I) 的双环的碳原子连接的键, 其中

[0387] G^2 代表氢或选自如下的基团: 卤素、硝基、氨基、氰基、 C_1-C_4 -烷基氨基、卤代- C_1-C_4 -烷基氨基、 C_1-C_4 -二烷基氨基、 C_1-C_4 -烷基、卤代- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、卤代- C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、卤代- C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、二(C_1-C_4 -烷氧基)- C_1-C_4 -烷基、二(卤代- C_1-C_4 -烷氧基)- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基-(C_1-C_4 -烷基硫烷基)- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基-(C_1-C_4 -烷基亚磺酰基)- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基-(C_1-C_4 -烷基磺酰基)- C_1-C_4 -烷基、二(C_1-C_4 -烷基硫烷基)- C_1-C_4 -烷基、二(卤代- C_1-C_4 -烷基硫烷基)- C_1-C_4 -烷基、二(羟基- C_1-C_4 -烷基硫烷基)- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基- C_1-C_4 -烷基、 $C(X^2)NR^3R^4$ 、 NR^6R^7 、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷

硫基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基, 杂环基基团: 二氧杂环己基、二氧杂环戊基、二氧杂环庚基、二氧杂环辛基、氧硫杂环己基、氧硫杂环戊基、氧硫杂环庚基、氧硫杂环辛基、二硫杂环己基、二硫杂环戊基、二硫杂环庚基、二硫杂环辛基、氧硫杂环己基氧化物、氧硫杂环戊基氧化物、氧硫杂环庚基氧化物、氧硫杂环辛基氧化物、氧硫杂环己基二氧化物、氧硫杂环戊基二氧化物、氧硫杂环庚基二氧化物、氧硫杂环辛基二氧化物、吗啉基、三唑啉酮基、噁唑啉基、二氢噁二嗪基、二氢二噁嗪基、二氢噁唑基、二氢噁嗪基和吡唑啉酮基(其本身可被C₁-C₄-烷基、卤代-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基取代), 苯基(其本身可被卤素、氰基、硝基、C₁-C₄-烷基和卤代-C₁-C₄-烷基取代), 杂芳基基团: 吡啶基、吡啶基N-氧化物、嘧啶基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、噻唑基、呋喃基、噻吩基、三唑基、四唑基、噁二唑基、噻二唑基、吡嗪基、三嗪基、四嗪基和异喹啉基(其本身可被卤素、硝基、C₁-C₄-烷基、卤代-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、卤代-C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷硫基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基和C₃-C₆-环-C₁-C₄-烷基取代), 以及杂芳基-C₁-C₄-烷基基团: 三唑基-C₁-C₄-烷基、吡啶基-C₁-C₄-烷基、嘧啶基-C₁-C₄-烷基和噁二唑基-C₁-C₄-烷基(其本身可被卤素和C₁-C₄-烷基取代), 或者

[0388] R^{2aa}代表选自如下的B基团



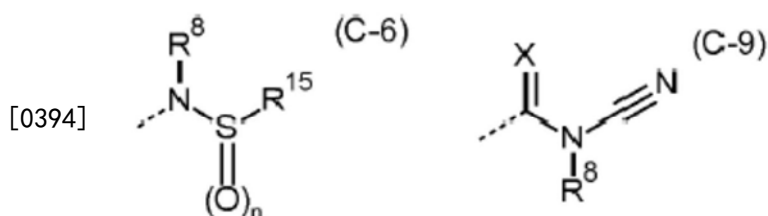
[0390] 其中

[0391] G²代表选自如下的基团: 卤素、硝基、氨基、氰基、C₁-C₄-烷基氨基、卤代-C₁-C₄-烷基

氨基、C₁-C₄-二烷基氨基、卤代-C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、卤代C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、二(C₁-C₄-烷氧基)-C₁-C₄-烷基、二(卤代-C₁-C₄-烷氧基)-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-(C₁-C₄-烷基硫烷基)-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-(C₁-C₄-烷基亚磺酰基)-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-(C₁-C₄-烷基磺酰基)-C₁-C₄-烷基、二(C₁-C₄-烷基硫烷基)-C₁-C₄-烷基、二(卤代-C₁-C₄-烷基硫烷基)-C₁-C₄-烷基、二(羟基-C₁-C₄-烷基硫烷基)-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基羰基、C₁-C₄-烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基、C(X²)NR³R⁴、NR⁶R⁷、C₁-C₄-烷硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-卤代烷硫基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基，杂环基团：二氧杂环己基、二氧杂环戊基、二氧杂环庚基、二氧杂环辛基、氧硫杂环己基、氧硫杂环戊基、氧硫杂环庚基、氧硫杂环辛基、二硫杂环己基、二硫杂环戊基、二硫杂环庚基、二硫杂环辛基、氧硫杂环己基氧化物、氧硫杂环戊基氧化物、氧硫杂环庚基氧化物、氧硫杂环辛基氧化物、氧硫杂环己基二氧化物、氧硫杂环戊基二氧化物、氧硫杂环庚基二氧化物、氧硫杂环辛基二氧化物、吗啉基、三唑啉酮基、噁唑啉基、二氢噁二嗪基、二氢二噁嗪基、二氢噁唑基、二氢噁嗪基和吡唑啉酮基(其本身可被C₁-C₄-烷基、卤代-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基取代)，苯基(其本身可被卤素、氰基、硝基、C₁-C₄-烷基和卤代-C₁-C₄-烷基取代)，杂芳基基团：咪唑基、吡唑基、噁唑基、呋喃基、噻吩基、三唑基、四唑基、噁二唑基、噻二唑基、吡嗪基、三嗪基、四嗪基和异喹啉基(其本身可被卤素、硝基、C₁-C₄-烷基、卤代-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、卤代-C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷硫基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基和C₃-C₆-环-C₁-C₄-烷基取代)，以及杂芳基-C₁-C₄-烷基基团：三唑基-C₁-C₄-烷基、吡啶基-C₁-C₄-烷基、嘧啶基-C₁-C₄-烷基和噁二唑基-C₁-C₄-烷基(其本身可被卤素和C₁-C₄-烷基取代)，

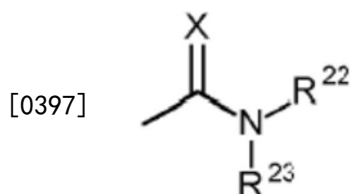
[0392] 或者，如果R²代表a)或aa)下所列基团之一，则

[0393] G²还代表选自(C-6)和(C-9)的C基团



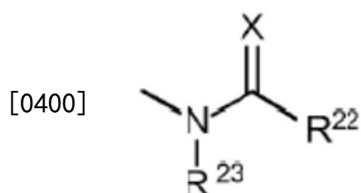
[0395] 其中虚线代表与B基团连接的键，或者

[0396] R^{2c})代表下式的基团



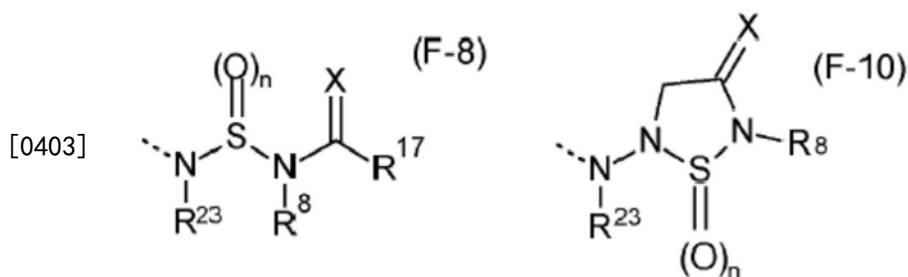
[0398] 或者

[0399] R^{2d})代表下式的基团



[0401] 或者

[0402] R^{2e} 代表选自 (F-8) 和 (F-10) 的 F 基团



[0404] 其中虚线代表与式 (I) 中的碳原子连接的键, 或者

[0405] R^{2f} 代表选自 C_1 - C_6 -卤代烷基、羧基和氨基的基团,

[0406] 其中

[0407] X 代表氧,

[0408] X^2 代表氧、硫、 NR^5 或 NOH ,

[0409] n 代表 2,

[0410] R^3 代表 C_1 - C_4 -烷基,

[0411] R^4 代表选自如下的基团: 氢、 C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷基、氰基- C_1 - C_4 -烷基、 C_2 - C_4 -炔基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基- C_1 - C_4 -烷基和 C_1 - C_4 -烷硫基- C_1 - C_4 -烷基,

[0412] R^5 代表选自如下的基团: 氢、 C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷基、氰基- C_1 - C_4 -烷基、 C_2 - C_4 -炔基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基- C_1 - C_4 -烷基和 C_1 - C_4 -烷硫基- C_1 - C_4 -烷基,

[0413] R^6 代表氢或 C_1 - C_4 -烷基,

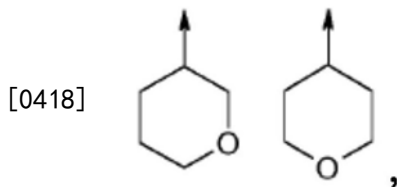
[0414] R^7 代表选自如下的基团: 氢、 C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷基、氰基- C_1 - C_4 -烷基、 C_2 - C_4 -炔基、 C_1 - C_4 -烷氧基、卤代- C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷硫基- C_1 - C_4 -烷基、芳基- C_1 - C_4 -烷基和杂芳基- C_1 - C_4 -烷基, 或者

[0415] R^6 和 R^7 与它们所连接的氮原子一起形成 4 至 7 元环, 所述 4 至 7 元环可含有一个或两个选自氮、氧和硫 (其中氧原子和硫原子不能彼此直接相邻) 的其他杂原子,

[0416] R^8 代表选自如下的基团: 氢、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、氰基- C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -卤代烷氧基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_6 -烷基, 各自任选地被卤素取代的 C_1 - C_6 -烷基羰基和 C_1 - C_6 -烷基磺酰基, 任选地被卤素取代的 C_1 - C_6 -烷氧基羰基, 任选地被卤素、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_6 -卤代烷基和氰基取代的 C_3 - C_6 -环烷基羰基, 或者代表阳离子或任选地被 C_1 - C_6 -烷基或芳基- C_1 - C_6 -烷基取代的铵离子,

[0417] R^9 代表选自如下的基团: 各自任选地被卤素、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 C_1 -

C₄-烷基硫基、C₁-C₄-卤代烷基硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基和C₁-C₄-卤代烷基磺酰基取代的C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基和C₂-C₄-炔基；各自任选地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基取代的C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₆-烷基和C₃-C₄-环烯基，其中一个或两个环成员可各自被选自硫、氧（其中氧原子不能彼此直接相邻）和氮的杂原子代替（并且，此处特别地代表



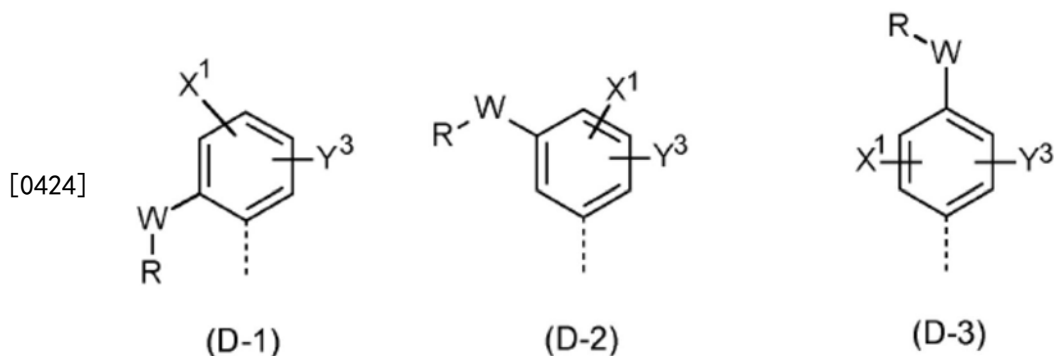
[0419] 其中箭头各自表示与基团 (C-1) 中的硫原子连接的键；各自任选地被卤素、氰基（以及在烷基部分中的）、硝基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷基硫基、C₁-C₄-卤代烷基硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、氨基、C₁-C₄-烷基氨基、二 (C₁-C₄-烷基) 氨基、C₁-C₄-烷基羰基氨基、C₁-C₄-烷氧基羰基氨基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基羰基、C₁-C₄-烷氧基羰基或氨基羰基取代的芳基、杂芳基、芳基-C₁-C₄-烷基和杂芳基-C₁-C₄-烷基；或代表NR'R''，其中R'和R''彼此独立地代表选自氢和C₁-C₄-烷基的基团，

[0420] R¹⁵代表选自如下的基团：各自任选地被甲基取代的C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基和C₂-C₆-炔基，各自任选地被甲基、卤素、氰基或氨基甲酰基取代的C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₂-烷基和C₃-C₆-环烯基，或者

[0421] 基团 (C-6) 中R⁸和R¹⁵还可与它们所连接的N-S(O)_n基团一起形成饱和或不饱和的且任选取代的4至8元环，所述4至8元环可含有一个或两个选自硫、氧（其中氧原子和硫原子不能彼此直接相邻）和氮的其他杂原子和/或至少一个羰基，

[0422] R¹⁷代表选自如下的基团：各自任选地被卤素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷基硫基、C₁-C₄-卤代烷基硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基或C₁-C₄-卤代烷基磺酰基取代的C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基和C₂-C₄-炔基，各自任选地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或C₁-C₄-卤代烷氧基取代的C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基和C₃-C₄-环烯基、N-吡咯烷基、N-哌啶基、N-吗啉基、N-硫代吗啉基、N-硫代吗啉基1-氧化物、N-硫代吗啉基1,1-二氧化物、N-哌嗪基、N-1-甲基哌嗪基或N-2-氧代-1-甲基哌嗪基，各自任选地被卤素、氰基（以及在烷基部分中的）、硝基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷基硫基、C₁-C₄-卤代烷基硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、氨基、C₁-C₄-烷基氨基、二 (C₁-C₄-烷基) 氨基、C₁-C₄-烷基羰基氨基、C₁-C₄-烷氧基羰基氨基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基羰基、C₁-C₄-烷氧基羰基或氨基羰基取代的芳基、杂芳基、芳基-C₁-C₄-烷基和杂芳基-C₁-C₄-烷基，或者代表NR'R''，其中R'和R''彼此独立地代表选自氢和C₁-C₄-烷基的基团，

[0423] R²²代表选自 (D-1) 至 (D-3) 的D基团



[0425] 其中虚线代表与基团c)中的氮原子或与基团d)中的碳原子连接的键,

[0426] R代表 $\text{NR}^{18}\text{R}^{19}$,或代表下述基团:各自任选被卤素单取代至七取代、被氧(得到 $\text{C}=\text{O}$)单取代或二取代或者被氰基单取代或二取代的 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -烯基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -炔基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-S- $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-S(O)- $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-S(O)₂- $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基、 $\text{R}^{18}\text{-CO-C}_1\text{-C}_2$ -烷基、 $\text{NR}^{18}\text{R}^{19}\text{-CO-C}_1\text{-C}_2$ -烷基,任选被氧(得到 $\text{C}=\text{O}$)、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷基单取代或二取代的 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基,任选被氧(得到 $\text{C}=\text{O}$)、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷基单取代或二取代的 $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烯基,任选被氧(得到 $\text{C}=\text{O}$)、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷基单取代或二取代的 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基,任选被氧(得到 $\text{C}=\text{O}$)、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷基单取代或二取代的 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烯基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基,任选被氧(得到 $\text{C}=\text{O}$)、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷基单取代或二取代的杂环基,任选被氧(得到 $\text{C}=\text{O}$)、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷基单取代或二取代的杂环基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基,或各自任选被卤素、氰基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基或 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷氧基单取代至三取代的苯基、苯基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、杂芳基和杂芳基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基,

[0427] X^1 代表选自如下的基团:氢、氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷氧基,

[0428] Y^3 代表选自如下的基团:氢、氟、氯、溴、碘、氰基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷氧基,

[0429] W代表选自如下的基团:S、SO和 SO_2 ,

[0430] R^{18} 代表选自如下的基团:氢,羟基,各自任选被卤素单取代或多取代的或被氰基单取代或二取代的 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-S- $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-S(O)- $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-S(O)₂- $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基羰基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基羰基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基- $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基、杂环基、杂环基- $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基,以及各自任选被 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_3$ -卤代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_3$ -卤代烷氧基、环丙基、氟、氯、溴或氰基单取代至三取代的苯基、苄基、吡啶基、噻啶基、噻唑基、噁唑基、吡唑基、噻吩基、呋喃基、吡啶基甲基和噻唑基甲基,

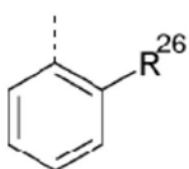
[0431] R^{19} 代表氢,代表碱金属离子或碱土金属离子,或代表任选被 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基单取代至四取代的铵离子,或代表各自任选被卤素单取代或多取代的或被氰基单取代或二取代的下列基团: $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-S- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-S(O)- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-S(O)₂- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基,

[0432] R^{23} 如果 R^2 代表基团c), 则 R^{23} 代表选自如下的基团: 氢、 C_1 - C_6 -烷基、 C_2 - C_4 -烯基、 C_2 - C_4 -炔基、 C_1 - C_4 -烷硫基- C_1 - C_4 -烷基、 C_2 - C_4 -烯硫基- C_1 - C_4 -烷基、氰基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基,

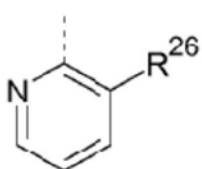
[0433] R^{23} 如果 R^2 代表基团d), 则 R^{23} 代表选自如下的基团: 氢、 C_1 - C_6 -烷基、 C_2 - C_4 -烯基、 C_2 - C_4 -炔基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_3 - C_6 -环烯基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_2 - C_6 -烯氧基、 C_2 - C_6 -炔氧基、 C_3 - C_6 -环烷氧基、 C_1 - C_4 -烷硫基- C_1 - C_4 -烷基、 C_2 - C_4 -烯硫基- C_1 - C_4 -烷基、氰基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基,

[0434] 或者, 在 $R^2=d$) 的情况下,

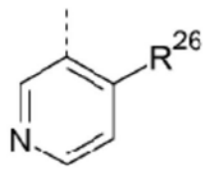
[0435] R^{22} 还代表选自如下的E基团



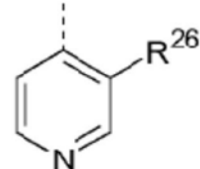
E-1



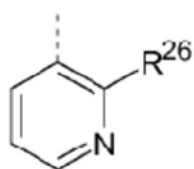
E-2



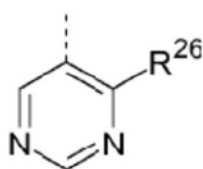
E-3



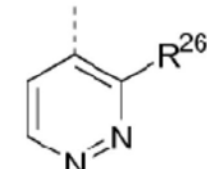
E-4



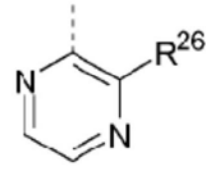
E-5



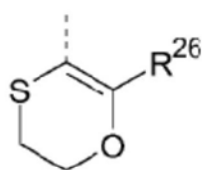
E-6



E-10

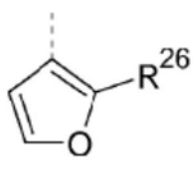


E-11

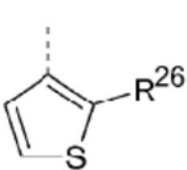


E-13

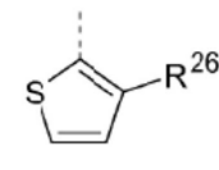
[0436]



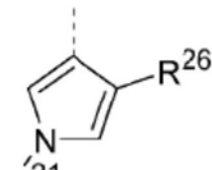
E-18



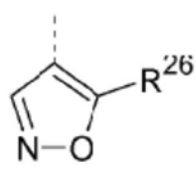
E-21



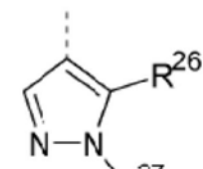
E-23



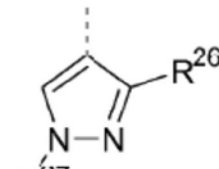
E-25



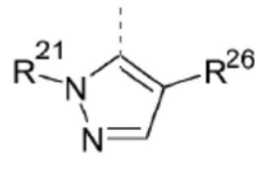
E-27



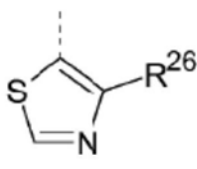
E-31



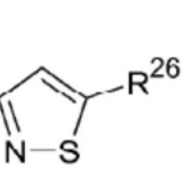
E-35



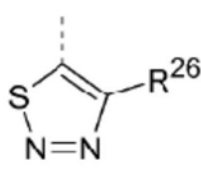
E-36



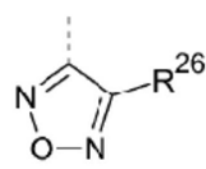
E-39



E-44



E-49

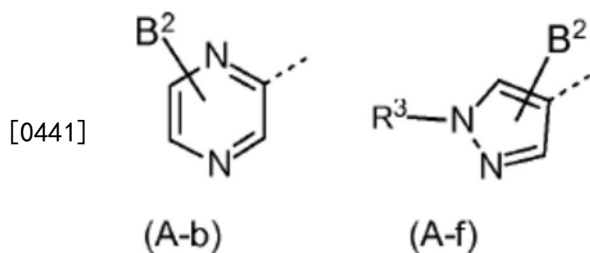


E-51

[0437] R^{27} 代表氢或 C_1 - C_4 -烷基,且[0438] R^{26} 代表氢、 C_1 - C_4 -烷基、 C_2 - C_4 -烯基、 C_2 - C_4 -炔基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_2 -烷基、 C_1 - C_4 -烷硫基- C_1 - C_2 -烷基、 C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基- C_1 - C_2 -烷基、 C_1 - C_4 -烷基磺酰基- C_1 - C_2 -烷基或氰基- C_1 - C_4 -烷基。

[0439] 优选范围(3):非常特别优选下列式(I)的化合物,其中

[0440] A代表选自 (A-b) 和 (A-f) 的A基团

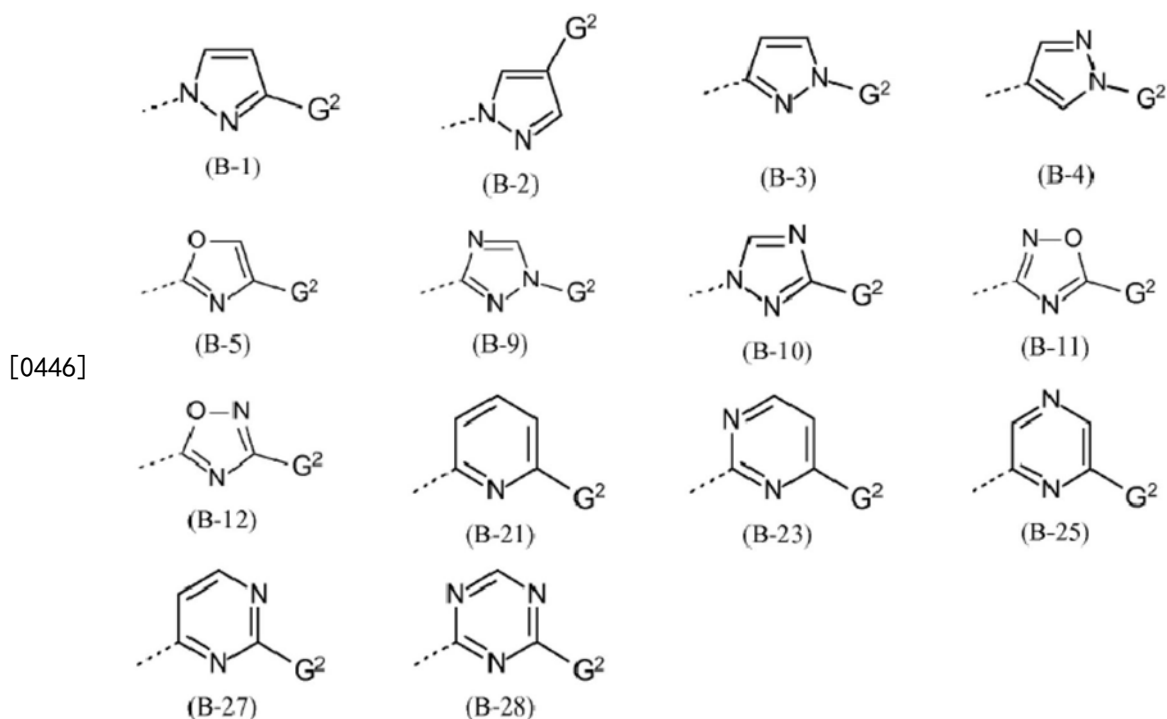


[0442] 其中虚线代表与双环的氮原子连接的键，

[0443] B²代表氢，

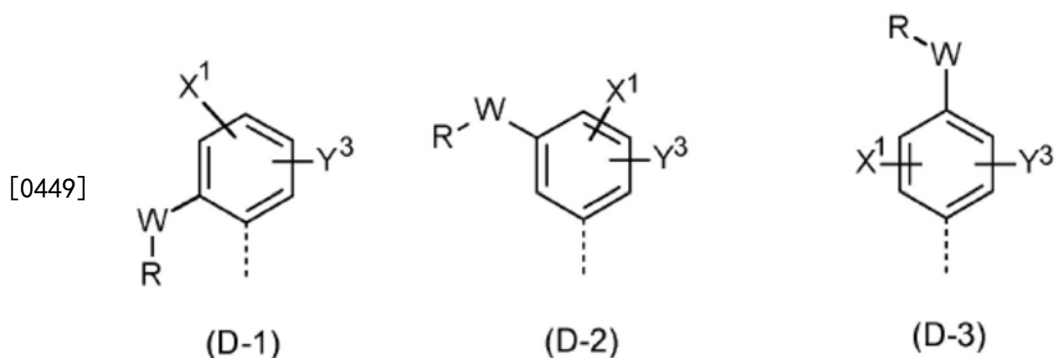
[0444] R¹代表氢，

[0445] R²a) 代表选自如下的B基团



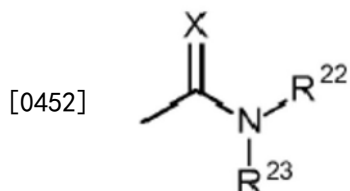
[0447] 其中虚线代表与式 (I) 的双环的碳原子连接的键，或者

[0448] R²b) 代表选自 (D-1) 至 (D-3) 的基团



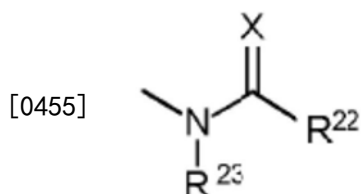
[0450] 其中虚线代表与式 (I) 的双环的碳原子连接的键，或者

[0451] R²c) 代表下式的基团



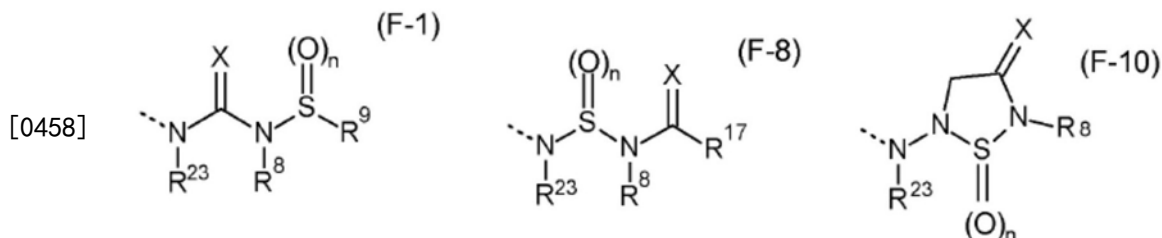
[0453] 或者

[0454] R^{2d} 代表下式的基团



[0456] 或者

[0457] R^{2e} 代表选自 (F-1)、(F-8) 和 (F-10) 的基团

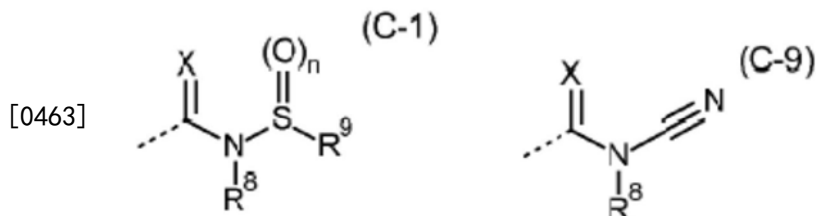


[0459] 其中虚线代表与式 (I) 中的氮原子连接的键, 或者

[0460] R^{2f} 代表选自如下的基团: C_1-C_6 -卤代烷基、羧基和氨基, 其中

[0461] G^2 代表氢或选自如下的基团: 卤素、硝基、氨基、氰基、 C_1-C_4 -烷基氨基、卤代- C_1-C_4 -烷基氨基、二- (C_1-C_4 -烷基)-氨基、 C_1-C_4 -烷基、卤代- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、卤代- C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、卤代- C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、二 (C_1-C_4 -烷氧基)- C_1-C_4 -烷基、二 (卤代- C_1-C_4 -烷氧基)- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- (C_1-C_4 -烷基硫烷基)- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- (C_1-C_4 -烷基亚磺酰基)- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- (C_1-C_4 -烷基磺酰基)- C_1-C_4 -烷基、二 (C_1-C_4 -烷基硫烷基)- C_1-C_4 -烷基、二 (卤代- C_1-C_4 -烷基硫烷基)- C_1-C_4 -烷基、二 (羟基- C_1-C_4 -烷基硫烷基)- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基- C_1-C_4 -烷基、 $C(X^2)NR^3R^4$ 、 NR^6R^7 、 C_1-C_4 -烷基硫基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基硫基、 C_1-C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基, 或者

[0462] G^2 代表 C 基团 (C-1) 或 (C-9)



[0464] 其中虚线代表与 B 基团连接的键,

[0465] X 代表氧,

[0466] X^1 代表选自如下的基团: 氢、氟、氯、溴、氰基、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧

基、二氟甲氧基和三氟甲氧基,

[0467] X^2 代表氧、硫、 NR^5 或NOH,

[0468] n代表2,

[0469] R代表 $NR^{18}R^{19}$,或代表下述基团:各自任选被氟、氯单取代、二取代、三取代、四取代或五取代的或者被氰基单取代或二取代的 C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_4 -烯基、 C_3-C_4 -炔基、 C_1-C_2 -烷氧基- C_1-C_2 -烷基和 C_1-C_2 -烷基-S- C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_2 -烷基-S(O)- C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_2 -烷基-S(O)₂- C_1-C_2 -烷基, R^{18} -CO- C_1-C_2 -烷基, $NR^{18}R^{19}$ -CO- C_1-C_2 -烷基,任选被 C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_2 -烷氧基或 C_1-C_2 -卤代烷基或被氧原子(得到C=O)单取代或二取代的 C_3-C_6 -环烷基,任选被 C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_2 -烷氧基或 C_1-C_2 -卤代烷基或被氧原子(得到C=O)单取代或二取代的 C_3-C_6 -环烯基,任选被 C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_2 -烷氧基或 C_1-C_2 -卤代烷基单取代或二取代的 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_4 -烷基,任选被 C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_2 -烷氧基或 C_1-C_2 -卤代烷基单取代或二取代的 C_3-C_6 -环烯基- C_1-C_2 -烷基,任选被 C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_2 -烷氧基或 C_1-C_2 -卤代烷基单取代或二取代的杂环基,任选被 C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_2 -烷氧基或 C_1-C_2 -卤代烷基单取代或二取代的杂环基- C_1-C_2 -烷基,或各自任选被氟、氯、溴、氰基、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基单取代或二取代的苯基、苄基、吡啶基、噻啶基、噻唑基、噁唑基、吡唑基、噻吩基、呋喃基、吡啶基甲基或噻唑基甲基,

[0470] R^3 代表 C_1-C_4 -烷基,

[0471] R^4 代表选自如下的基团:氢、 C_1-C_4 -烷基、卤代- C_1-C_4 -烷基、氰基- C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -炔基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基- C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷硫基- C_1-C_4 -烷基,

[0472] R^5 代表选自如下的基团:氢、 C_1-C_4 -烷基、卤代- C_1-C_4 -烷基、氰基- C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -炔基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基- C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷硫基- C_1-C_4 -烷基,

[0473] R^6 代表氢或 C_1-C_4 -烷基,

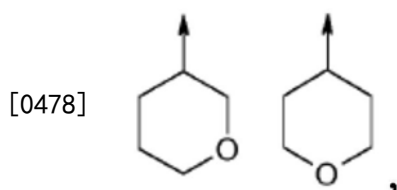
[0474] R^7 代表选自如下的基团:氢、 C_1-C_4 -烷基、卤代- C_1-C_4 -烷基、氰基- C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -炔基、 C_1-C_4 -烷氧基、卤代- C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷硫基- C_1-C_4 -烷基、芳基- C_1-C_4 -烷基和杂芳基- C_1-C_4 -烷基,或者

[0475] R^6 和 R^7 与它们所连接的氮原子一起形成4至7元环,所述4至7元环可含有一个或两个选自氮、氧和硫(其中氧原子和硫原子不能彼此直接相邻)的其他杂原子,

[0476] R^8 代表选自如下的基团:氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、氰基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、 C_2-C_6 -烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基,各自任选地被卤素取代的 C_1-C_6 -烷基羰基和 C_1-C_6 -烷基磺酰基,任选地被卤素取代的 C_1-C_6 -烷氧基羰基,任选地被卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷基和氰基取代的 C_3-C_6 -环烷基羰基,或者代表阳离子或任选地被 C_1-C_6 -烷基或芳基- C_1-C_6 -烷基取代的铵离子,

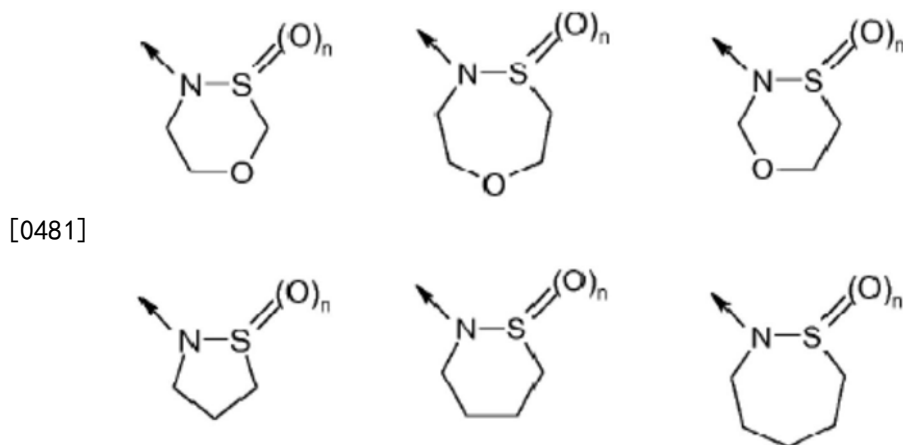
[0477] R^9 代表选自如下的基团:各自任选地被卤素、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -卤代烷硫基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基和 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基取代的 C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -烯基和 C_2-C_4 -炔基;各自任选地被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基取代的 C_3-C_6 -环烷基、

C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基和C₃-C₄-环烯基, 其中一个或两个环成员可各自被选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子代替(并且, 此处特别地代表



[0479] 其中箭头各自表示与基团(C-1)和基团(F-1)中的硫原子连接的键); 各自任选地被卤素、氰基(以及在烷基部分中的)、硝基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷基硫基、C₁-C₄-卤代烷基硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、氨基、C₁-C₄-烷基氨基、二-(C₁-C₄-烷基)-氨基、C₁-C₄-烷基羰基氨基、C₁-C₄-烷氧基羰基氨基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基羰基、C₁-C₄-烷氧基羰基或氨基羰基取代的芳基、杂芳基、芳基-C₁-C₄-烷基和杂芳基-C₁-C₄-烷基; 或代表NR'R'', 其中R'和R''彼此独立地代表选自氢和C₁-C₄-烷基的基团, 或者

[0480] 基团(C-1)和基团(F-1)中的R⁸和R⁹还可与它们所连接的N-S(O)_n基团一起形成饱和或不饱和的且任选地被卤素、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基取代的5至7元环, 所述5至7元环可含有一个或两个选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子和/或至少一个且优选一个羰基, 特别地, R⁸和R⁹可与它们所连接的N-S(O)_n基团一起代表选自如下的基团



[0482] (其中箭头各自表示与C(X)基团连接的键),

[0483] R¹⁷代表选自如下的基团: 各自任选地被卤素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷基硫基、C₁-C₄-卤代烷基硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基和C₁-C₄-卤代烷基磺酰基取代的C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基和C₂-C₄-炔基, 各自任选地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基取代的C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基和C₃-C₄-环烯基、N-吡咯烷基、N-哌啶基、N-吗啉基、N-硫代吗啉基、N-硫代吗啉基1-氧化物、N-硫代吗啉基1,1-二氧化物、N-哌嗪基、N-1-甲基哌嗪基或N-2-氧代-1-甲基哌嗪基, 各自任选地被卤素、氰基(以及在烷基部分中的)、硝基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷基硫基、C₁-C₄-

卤代烷基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基、氨基、 C_1-C_4 -烷基氨基、二- $(C_1-C_4$ -烷基)-氨基、 C_1-C_4 -烷基羰基氨基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基氨基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_2-C_4 -炔基、 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基羰基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基或氨基羰基取代的芳基、杂芳基、芳基- C_1-C_4 -烷基、杂芳基- C_1-C_4 -烷基，或者代表 $NR'R''$ ，其中 R' 和 R'' 彼此独立地代表选自氢和 C_1-C_4 -烷基的基团，

[0484] R^{18} 代表选自如下的基团：氢，羟基，各自任选被氟、氯单取代、二取代、三取代、四取代或五取代的或被氰基单取代或二取代的 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基-S- C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_4 -烷基-S(O)- C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_4 -烷基-S(O)₂- C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_4 -烷基羰基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_3 -烷基、杂环基和杂环基- C_1-C_3 -烷基，以及各自任选被 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_3 -卤代烷基、 C_1-C_3 -烷氧基、 C_1-C_3 -卤代烷氧基、环丙基、氟、氯、溴或氰基单取代至三取代的苯基、苄基、吡啶基、嘧啶基、噻唑基、噁唑基、吡唑基、噻吩基、呋喃基、吡啶基甲基和噻唑基甲基，

[0485] R^{19} 代表氢，碱金属离子或碱土金属离子，代表任选被 C_1-C_4 -烷基单取代至四取代的铵离子，或代表各自任选被氟、氯单取代、二取代、三取代、四取代或五取代的或被氰基单取代或二取代的下列基团： C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_4 -烷基-S- C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_4 -烷基-S(O)- C_1-C_2 -烷基和 C_1-C_4 -烷基-S(O)₂- C_1-C_2 -烷基，

[0486] W代表选自如下的基团：S、SO和SO₂，

[0487] Y^3 代表选自如下的基团：氢、氟、氯、溴、氰基、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基和三氟甲氧基，

[0488] R^{22} 如果 R^2 代表基团c)，则 R^{22} 代表选自如下的基团： C_1-C_6 -烷基，任选地被氰基取代的 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷基磺基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺基、 C_1-C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基磺基- C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基- C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基- C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基亚磺酰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基磺基- C_2-C_4 -烯基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基- C_2-C_4 -烯基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基- C_2-C_4 -烯基、 C_2-C_4 -烯基磺基- C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -烯基亚磺酰基- C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -烯基磺酰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基羰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基羰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基羰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基羰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基氨基磺酰基、二- $(C_1-C_4$ -烷基)-氨基磺酰基，

[0489] R^{23} 如果 R^2 代表基团c)，则 R^{23} 代表选自如下的基团：氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_2-C_4 -炔基、 C_1-C_4 -烷基磺基- C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -烯基磺基- C_1-C_4 -烷基、氰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基，

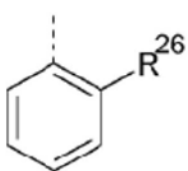
[0490] R^{22} 如果 R^2 代表基团d)，则 R^{22} 代表选自如下的基团： C_1-C_4 -烷基，任选地被氰基取代的 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷基磺基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基亚磺酰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基磺基- C_2-C_4 -烯基、 C_1-C_4 -烷基

亚磺酰基-C₂-C₄-烯基、C₁-C₄-烷基磺酰基-C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-烯硫基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基亚磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₄-烷基)-氨基磺酰基,

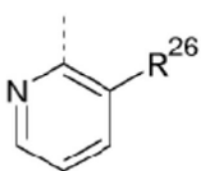
[0491] R²³如果R²代表基团d), 则R²³代表选自如下的基团: 氢、C₁-C₆-烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烯基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆-烯氧基、C₂-C₆-炔氧基、C₃-C₆-环烷氧基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯硫基-C₁-C₄-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基, 且

[0492] 在R²=d) 的情况下

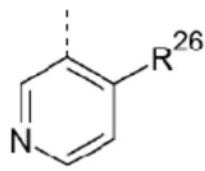
[0493] R²²还代表任选地被下列基团取代的苯基: 卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₃-C₆-烯氧基、C₃-C₆-炔氧基、C₁-C₆-烷氧基羰基氧基、C₁-C₆-烷基氨基、C₃-C₆-烯基氨基、C₃-C₆-炔基氨基、C₃-C₆-环烷基氨基、C₁-C₆-烷硫基、C₁-C₆-卤代烷硫基、C₃-C₆-烯硫基、C₃-C₆-炔硫基、C₃-C₆-环烷硫基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₆-烷基羰基、氨基羰基、C₁-C₆-烷基氨基羰基、二-(C₁-C₆-烷基)-氨基羰基、C₁-C₆-烷基羰基氨基, 或代表以下E基团之一



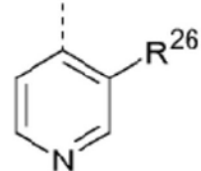
E-1



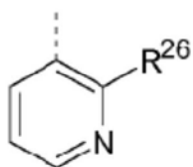
E-2



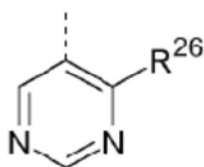
E-3



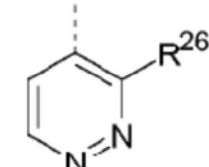
E-4



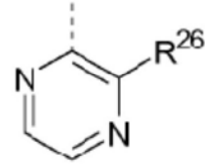
E-5



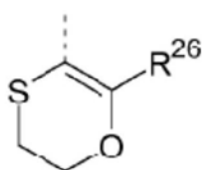
E-6



E-10

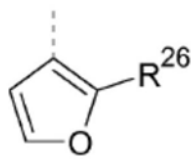


E-11

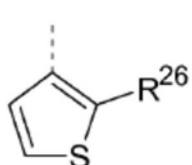


E-13

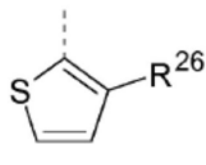
[0494]



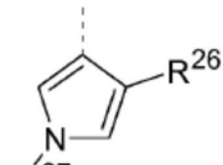
E-18



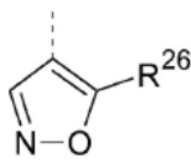
E-21



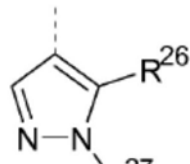
E-23



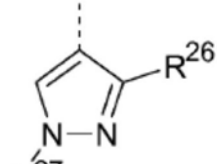
E-25



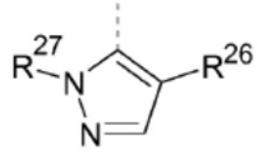
E-27



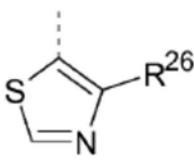
E-31



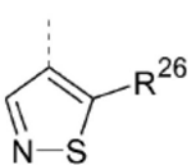
E-35



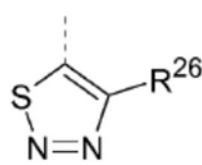
E-36



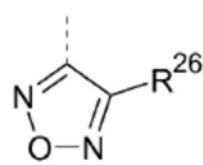
E-39



E-44



E-49

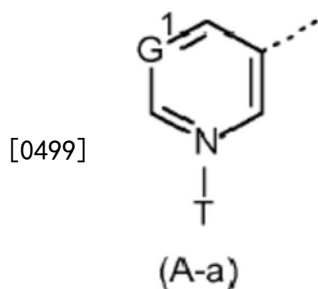


E-51

[0495] R^{27} 代表氢或甲基,且[0496] R^{26} 代表氢、甲基、2,2,2-三氟乙基、2,2-二氟乙基、丙烯基、炔丙基、环丙基、环丙基甲基、甲氧基甲基、甲硫基乙基、甲基亚磺酰基乙基、甲基磺酰基乙基或氰基甲基,以及

[0497] 下列式(I)的化合物,其中

[0498] A代表A基团



[0500] 其中虚线代表与式 (I) 的双环的氮原子连接的键，

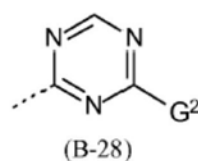
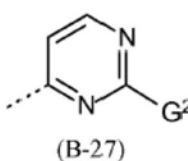
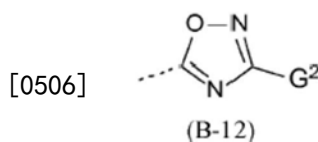
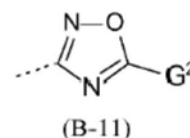
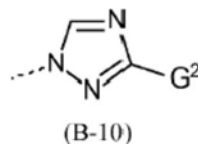
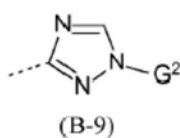
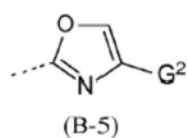
[0501] G^1 代表 N 或 C- B^1 ，

[0502] B^1 代表选自氢和氟的基团，

[0503] T 代表氧或电子对，

[0504] R^1 代表氢，

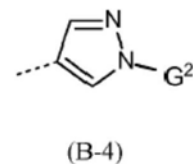
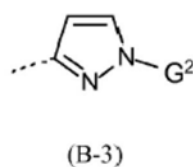
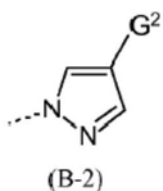
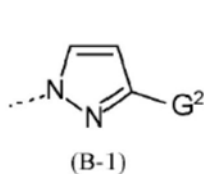
[0505] R^{2a} 代表选自如下的基团



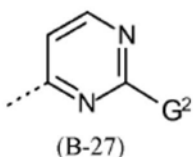
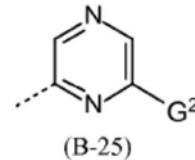
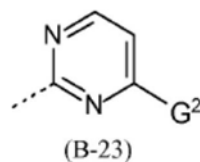
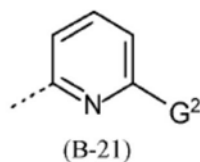
[0507] 其中虚线代表与式 (I) 的双环的碳原子连接的键，其中

[0508] G^2 代表氢或选自如下的基团：卤素、硝基、氨基、氰基、 C_1 - C_4 -烷基氨基、卤代- C_1 - C_4 -烷基氨基、 C_1 - C_4 -二烷基氨基、 C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、卤代- C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、二(C_1 - C_4 -烷氧基)- C_1 - C_4 -烷基、二(卤代- C_1 - C_4 -烷氧基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基-(C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基-(C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基-(C_1 - C_4 -烷基磺酰基)- C_1 - C_4 -烷基、二(C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、二(卤代- C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、二(羟基- C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基- C_1 - C_4 -烷基、 $C(X^2)NR^3R^4$ 、 NR^6R^7 、 C_1 - C_4 -烷硫基、 C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 -烷基磺酰基、 C_1 - C_4 -卤代烷硫基、 C_1 - C_4 -卤代烷基亚磺酰基和 C_1 - C_4 -卤代烷基磺酰基，或者

[0509] R^{2aa} 代表选自如下的基团

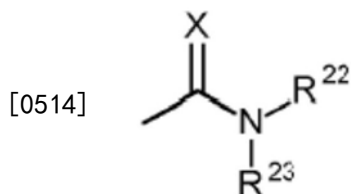


[0510]

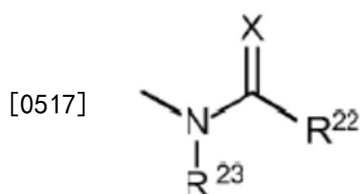


[0511] 其中

[0512] G^2 代表选自如下的基团:卤素、硝基、氨基、氰基、 C_1 - C_4 -烷基氨基、卤代- C_1 - C_4 -烷基氨基、 C_1 - C_4 -二烷基氨基、卤代- C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、二(C_1 - C_4 -烷氧基)- C_1 - C_4 -烷基、二(卤代- C_1 - C_4 -烷氧基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基-(C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基-(C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基-(C_1 - C_4 -烷基磺酰基)- C_1 - C_4 -烷基、二(C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、二(卤代- C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、二(羟基- C_1 - C_4 -烷基硫烷基)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基- C_1 - C_4 -烷基、 $C(X^2)NR^3R^4$ 、 NR^6R^7 、 C_1 - C_4 -烷基硫基、 C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 -烷基磺酰基、 C_1 - C_4 -卤代烷基硫基、 C_1 - C_4 -卤代烷基亚磺酰基和 C_1 - C_4 -卤代烷基磺酰基,或者

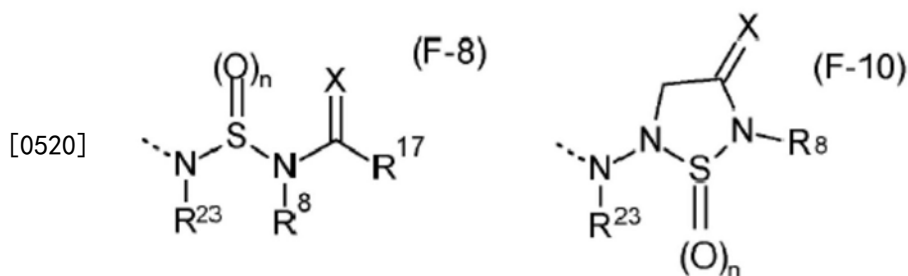
[0513] R^{2c} 代表下式的基团

[0515] 或者

[0516] R^{2d} 代表下式的基团

[0518] 或者

[0519] R^{2e} 代表选自 (F-8) 和 (F-10) 的基团

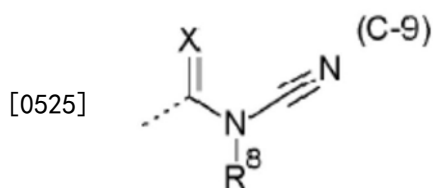


[0521] 其中虚线代表与式(I)中的氮原子连接的键,或者

[0522] R^{2f}代表选自C₁-C₆-卤代烷基、羧基和氨基的基团,

[0523] 或者

[0524] G²代表C基团



[0526] 其中虚线代表与B基团连接的键,

[0527] X代表氧,

[0528] X²代表氧、硫、NR⁵或NOH,

[0529] n代表2,

[0530] R³代表C₁-C₄-烷基,

[0531] R⁴代表选自如下的基团:氢、C₁-C₄-烷基、卤代-C₁-C₄-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基羰基、C₁-C₄-烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基和C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基,

[0532] R⁵代表选自如下的基团:氢、C₁-C₄-烷基、卤代-C₁-C₄-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基羰基、C₁-C₄-烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基和C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基,

[0533] R⁶代表氢或C₁-C₄-烷基,

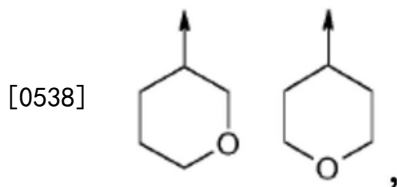
[0534] R⁷代表选自如下的基团:氢、C₁-C₄-烷基、卤代-C₁-C₄-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-炔基、C₁-C₄-烷氧基、卤代-C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基羰基、C₁-C₄-烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基、芳基-C₁-C₄-烷基和杂芳基-C₁-C₄-烷基,或者

[0535] R⁶和R⁷与它们所连接的氮原子一起形成4至7元环,所述4至7元环可含有一个或两个选自氮、氧和硫(其中氧原子和硫原子不能彼此直接相邻)的其他杂原子,

[0536] R⁸代表选自如下的基团:氢、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、氰基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₂-C₆-烯基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基,各自任选地被卤素取代的C₁-C₆-烷基羰基和C₁-C₆-烷基磺酰基,任选地被卤素取代的C₁-C₆-烷氧基羰基,任选地被卤素、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷基和氰基取代的C₃-C₆-环烷基羰基,或者代表阳离子或任选地被C₁-C₆-烷基或芳基-C₁-C₆-烷基取代的铵离子,

[0537] R⁹代表选自如下的基团:各自任选地被卤素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-

C₄-烷基硫基、C₁-C₄-卤代烷基硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基和C₁-C₄-卤代烷基磺酰基取代的C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基和C₂-C₄-炔基；各自任选地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基取代的C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基和C₃-C₄-环烯基，其中一个或两个环成员可各自被选自硫、氧（其中氧原子不能彼此直接相邻）和氮的杂原子代替（并且，此处特别地代表

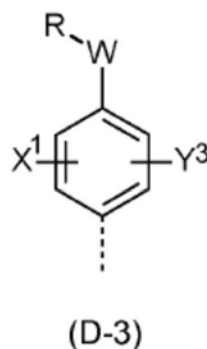
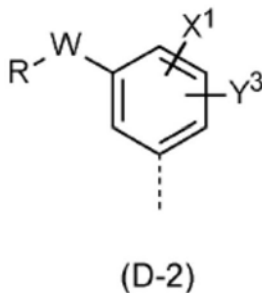
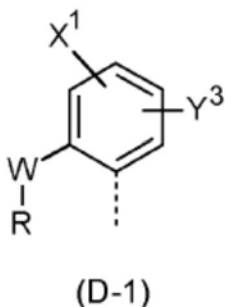


[0539] 其中箭头各自表示与基团 (C-1) 中的硫原子连接的键)；各自任选地被卤素、氰基（以及在烷基部分中的）、硝基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷基硫基、C₁-C₄-卤代烷基硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、氨基、C₁-C₄-烷基氨基、二-(C₁-C₄-烷基)氨基、C₁-C₄-烷基羰基氨基、C₁-C₄-烷氧基羰基氨基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基羰基、C₁-C₄-烷氧基羰基或氨基羰基取代的芳基、杂芳基、芳基-C₁-C₄-烷基和杂芳基-C₁-C₄-烷基，或代表NR'R''，其中R'和R''彼此独立地代表选自氢和C₁-C₄-烷基的基团，

[0540] R¹⁷代表选自如下的基团：各自任选地被卤素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷基硫基、C₁-C₄-卤代烷基硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基和C₁-C₄-卤代烷基磺酰基取代的C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基和C₂-C₄-炔基，各自任选地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基取代的C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基和C₃-C₄-环烯基、N-吡咯烷基、N-哌啶基、N-吗啉基、N-硫代吗啉基、N-硫代吗啉基1-氧化物、N-硫代吗啉基1,1-二氧化物、N-哌嗪基、N-1-甲基哌嗪基或N-2-氧代-1-甲基哌嗪基，各自任选地被卤素、氰基（以及在烷基部分中的）、硝基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷基硫基、C₁-C₄-卤代烷基硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、氨基、C₁-C₄-烷基氨基、二-(C₁-C₄-烷基)氨基、C₁-C₄-烷基羰基氨基、C₁-C₄-烷氧基羰基氨基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基羰基、C₁-C₄-烷氧基羰基或氨基羰基取代的芳基、杂芳基、芳基-C₁-C₄-烷基和杂芳基-C₁-C₄-烷基，或者代表NR'R''，其中R'和R''彼此独立地代表选自氢和C₁-C₄-烷基的基团，

[0541] R²²代表选自 (D-1) 至 (D-3) 的基团

[0542]



[0543] 其中虚线代表与基团c)中的氮原子或与基团d)中的碳原子连接的键,

[0544] R代表 $\text{NR}^{18}\text{R}^{19}$,或代表下述基团:各自任选地被氟、氯单取代、二取代、三取代、四取代或五取代的或者被氰基单取代或二取代的 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_4$ -烯基、 $\text{C}_3\text{-C}_4$ -炔基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基和 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基-S- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基-S(O)- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基-S(O)₂- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基, $\text{R}^{18}\text{-CO-C}_1\text{-C}_2$ -烷基, $\text{NR}^{18}\text{R}^{19}\text{-CO-C}_1\text{-C}_2$ -烷基, 任选被 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷氧基或 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -卤代烷基或被氧原子(得到 C=O)单取代或二取代的 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基, 任选被 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷氧基或 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -卤代烷基或被氧原子(得到 C=O)单取代或二取代的 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烯基, 任选被 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷氧基或 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -卤代烷基单取代或二取代的 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基, 任选被 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷氧基或 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -卤代烷基单取代或二取代的 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烯基- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基, 任选被 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷氧基或 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -卤代烷基单取代或二取代的杂环基, 任选被 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷氧基或 $\text{C}_1\text{-C}_2$ -卤代烷基单取代或二取代的杂环基- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基, 或各自任选地被氟、氯、溴、氰基、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基或三氟甲氧基单取代或二取代的苯基、苄基、吡啶基、嘧啶基、噻唑基、噁唑基、吡唑基、噻吩基、呋喃基、吡啶基甲基或噻唑基甲基,

[0545] X^1 代表选自如下的基团:氢、氟、氯、溴、氰基、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基和三氟甲氧基,

[0546] W代表选自如下的基团:S、SO和SO₂,

[0547] Y^3 代表选自如下的基团:氢、氟、氯、溴、氰基、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、二氟甲氧基和三氟甲氧基,

[0548] R^{18} 代表选自如下的基团:氢,羟基,各自任选地被氟、氯单取代、二取代、三取代、四取代或五取代的或被氰基单取代或二取代的 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-S- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-S(O)- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-S(O)₂- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基羰基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基羰基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基- $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基、杂环基和杂环基- $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基,以及各自任选地被 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_3$ -卤代烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_3$ -卤代烷氧基、环丙基、氟、氯、溴或氰基单取代至三取代的苯基、苄基、吡啶基、嘧啶基、噻唑基、噁唑基、吡唑基、噻吩基、呋喃基、吡啶基甲基和噻唑基甲基,

[0549] R^{19} 代表氢,碱金属离子或碱土金属离子,代表任选被 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基单取代至四取代的铵离子,或代表各自任选地被氟、氯单取代、二取代、三取代、四取代或五取代的或被氰基单取代或二取代的下列基团: $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-S- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-S(O)- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基-S(O)₂- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -烷基,或者

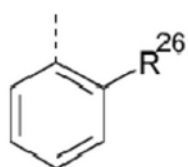
[0550] R^{23} 如果 R^2 代表基团c),则 R^{23} 代表选自如下的基团:氢、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ -烯基、 $\text{C}_2\text{-}$

C₄-炔基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯硫基-C₁-C₄-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基，

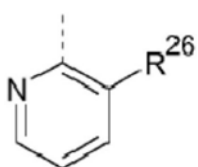
[0551] R²³如果R²代表基团d)，则R²³代表选自如下的基团：氢、C₁-C₆-烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烯基、C₁-C₆-烷氧基、C₂-C₆-烯氧基、C₂-C₆-炔氧基、C₃-C₆-环烷氧基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯硫基-C₁-C₄-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基，且

[0552] 在R²=d) 的情况下

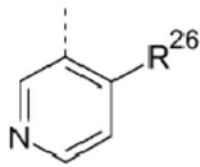
[0553] R²²还代表以下E基团之一



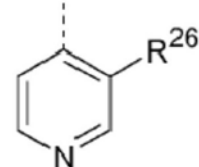
E-1



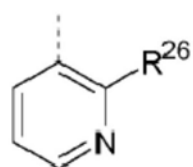
E-2



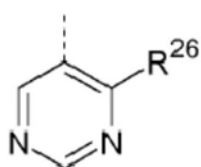
E-3



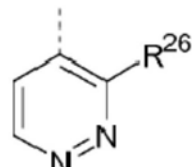
E-4



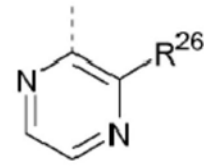
E-5



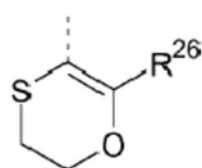
E-6



E-10

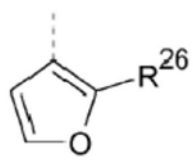


E-11

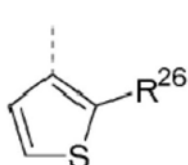


E-13

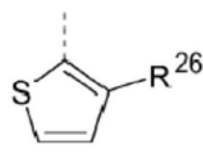
[0554]



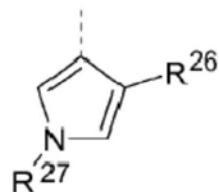
E-18



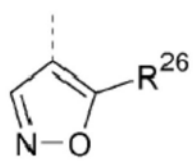
E-21



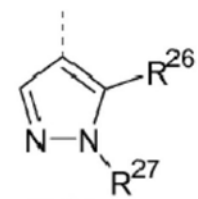
E-23



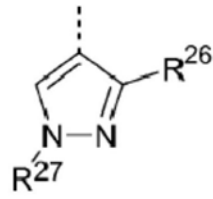
E-25



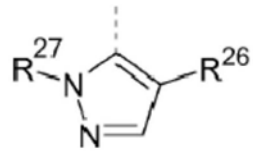
E-27



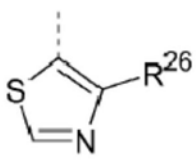
E-31



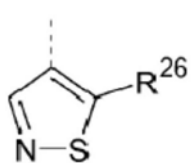
E-35



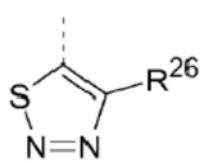
E-36



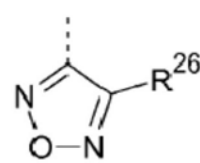
E-39



E-44



E-49

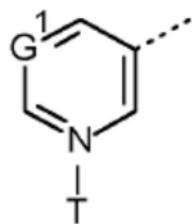


E-51

[0555] R^{27} 代表氢或甲基,且[0556] R^{26} 代表氢、甲基、2,2,2-三氟乙基、2,2-二氟乙基、丙烯基、炔丙基、环丙基、环丙基甲基、甲氧基甲基、甲硫基乙基、甲基亚磺酰基乙基、甲基磺酰基乙基或氰基甲基。

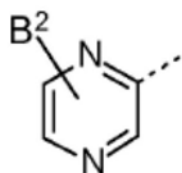
[0557] 优选范围(4):一组特别的式(I)的化合物为下列式(I)的化合物,其中

[0558] A代表选自(A-a)、(A-b)和(A-f)的基团

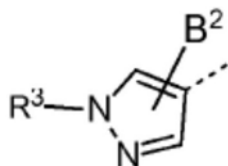


(A-a)

[0559]



(A-b)

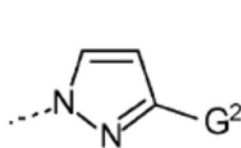


(A-f)

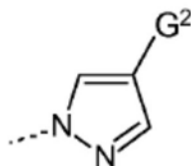
[0560] 其中虚线代表与双环的氮原子连接的键，

[0561] G^1 代表N或C- B^1 ，[0562] B^1 代表选自氢和氟的基团，[0563] B^2 代表氢，

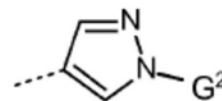
[0564] T代表电子对，

[0565] R^1 代表氢，[0566] $R^2a)$ 代表以下基团之一

(B-1)

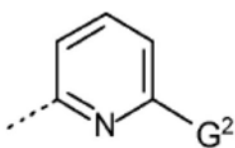


(B-2)

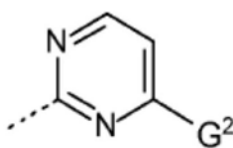


(B-4)

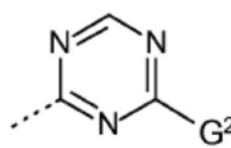
[0567]



(B-21)

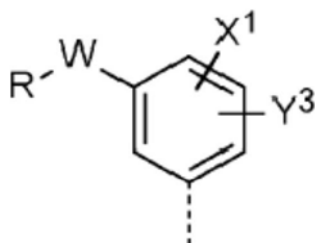


(B-23)



(B-28)

[0568] 其中虚线代表与式(I)的双环的碳原子连接的键，或者

[0569] $R^2b)$ 代表 (D-2) 基团

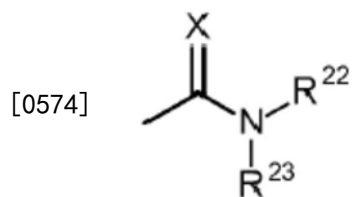
(D-2)

[0570]

[0571] 其中虚线代表与式 (I) 的双环的碳原子连接的键,

[0572] 或者

[0573] R^{2c} 代表下式的基团



[0575] 或者

[0576] R^{2f} 代表 C_1 - C_6 -卤代烷基, 其中

[0577] G^2 代表选自氢、 C_1 - C_4 -烷基和卤代- C_1 - C_4 -烷基的基团,

[0578] X 代表氧,

[0579] X^1 代表选自氢、氟、氯和溴的基团,

[0580] R 代表任选被氟、氯单取代、二取代、三取代、四取代或五取代的 C_1 - C_4 -烷基,

[0581] R^3 代表 C_1 - C_4 -烷基,

[0582] W 代表选自 S、SO 和 SO₂ 的基团,

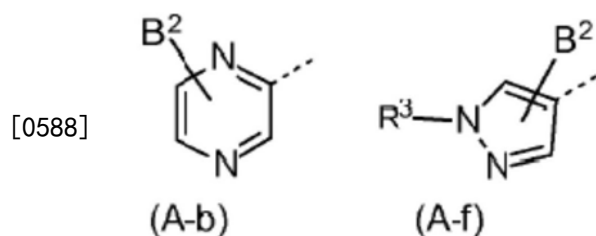
[0583] Y^3 代表甲基或乙基,

[0584] R^{22} 代表选自如下的基团: C_1 - C_6 -烷基, 任选被氰基取代的 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷基磺酰基和二 (C_1 - C_4 -烷基氨基) 磺酰基, 且

[0585] R^{23} 代表氢或 C_1 - C_6 -烷基。

[0586] 优选范围 (5): 另一组特别的式 (I) 的化合物为下列式 (I) 的化合物, 其中

[0587] A 代表选自 (A-b) 和 (A-f) 的 A 基团

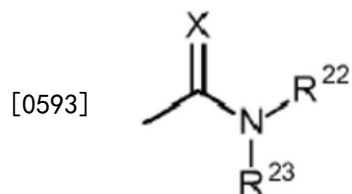


[0589] 其中虚线代表与式 (I) 的双环的氮原子连接的键,

[0590] B^2 代表氢,

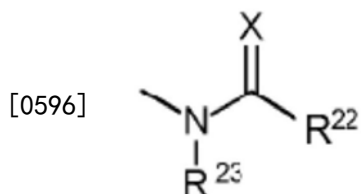
[0591] R^1 代表氢,

[0592] R^{2c} 代表下式的基团



[0594] 或者

[0595] R^{2d} 代表下式的基团



[0597] X代表氧,

[0598] R^3 代表 C_1 - C_4 -烷基,

[0599] R^{22} 如果 R^2 代表基团c), 则 R^{22} 代表选自如下的基团: C_1 - C_6 -烷基, 任选被氰基取代的 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷基磺酰基、 C_1 - C_4 -烷基硫基- C_1 - C_4 -烷基、二(C_1 - C_4 -烷基)氨基磺酰基,

[0600] R^{23} 如果 R^2 代表基团c), 则 R^{23} 代表选自氢和 C_1 - C_6 -烷基的基团,

[0601] R^{22} 如果 R^2 代表基团d), 则 R^{22} 代表选自如下的基团: C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷基硫基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基- C_1 - C_4 -烷基和 C_1 - C_4 -烷基磺酰基- C_1 - C_4 -烷基,

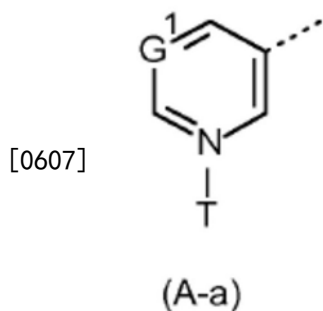
[0602] R^{23} 如果 R^2 代表基团d), 则 R^{23} 代表选自氢和 C_1 - C_6 -烷基的基团, 且

[0603] 在 $R^2=d$ 的情况下

[0604] R^{22} 还代表任选地被卤素、 C_1 - C_6 -烷基和 C_1 - C_6 -卤代烷基亚磺酰基取代的苯基, 以及

[0605] 下列式(I)的化合物, 其中

[0606] A代表A基团



[0608] 其中虚线代表与式(I)的双环的氮原子连接的键,

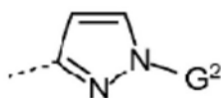
[0609] G^1 代表N或 $C-B^1$,

[0610] B^1 代表选自氢和氟的基团,

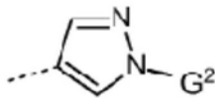
[0611] T代表电子对,

[0612] R^1 代表氢,

[0613] R^{2aa} 代表选自如下的基团

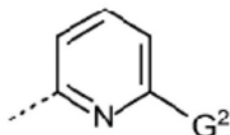


(B-3)

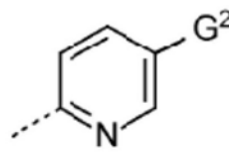


(B-4)

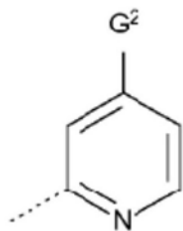
[0614]



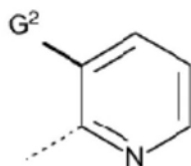
(B-21)



(B-22)



(B-35)



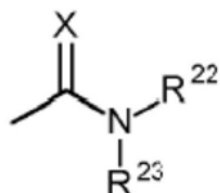
(B-36)

[0615] 其中

[0616] G^2 代表选自如下的基团：卤素、 C_1 - C_4 -烷基硫基、 C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 -烷基磺酰基、 C_1 - C_4 -卤代烷基硫基、 C_1 - C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 -卤代烷基磺酰基、 C_1 - C_4 -烷基硫基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷基磺酰基- C_1 - C_4 -烷基，或者

[0617] R^{2c} 代表下式的基团

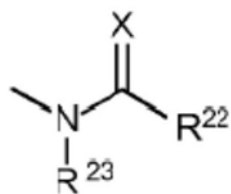
[0618]



[0619] 或者

[0620] R^{2d} 代表下式的基团

[0621]

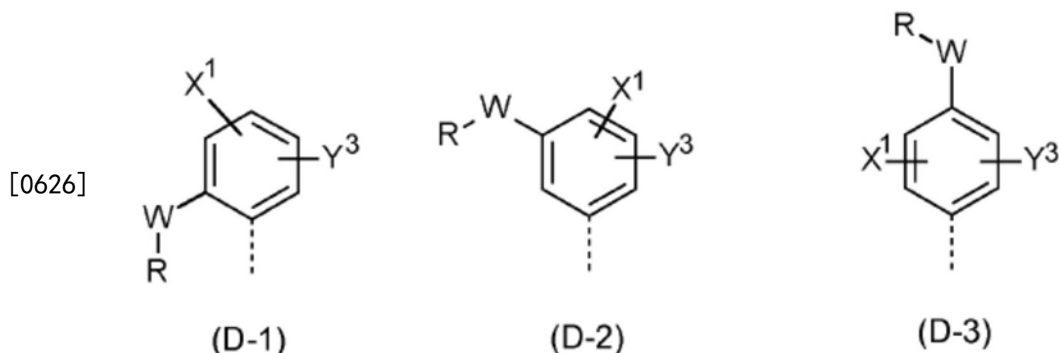


[0622] 或者

[0623] R^{2f} 代表卤代烷基，

[0624] X代表氧，

[0625] R^{22} 代表选自 (D-1) 至 (D-3) 的基团



[0627] 其中虚线代表与基团c)中的氮原子或与基团d)中的碳原子连接的键,

[0628] R代表各自任选被氟、氯单取代、二取代、三取代、四取代或五取代的C₁-C₄-烷基,

[0629] X¹代表选自氢、氟、氯、溴、甲基和乙基的基团,

[0630] W代表选自S、SO和SO₂的基团,

[0631] Y³代表选自氢、氟、氯、溴、甲基和乙基的基团。

[0632] 当在上述定义的环中存在硫和/或氮时,例如在诸如“其中所述环可含有至少一个选自硫、氧(其中氧原子和硫原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子”或“其中一个或两个环成员可各自被选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子代替”的表述中,除非另有说明,硫还可以SO或SO₂的形式存在;如果氮不为-N=的形式,则除NH外还可以N-烷基(尤其是N-C₁-C₆-烷基)的形式存在。

[0633] 在其组合形成优选范围(1)的优选的定义中,除非另有说明:

[0634] 阳离子代表选自下述的碱金属离子:锂、钠、钾、铷、铯,优选锂、钠、钾,或

[0635] 选自下述的碱土金属离子:铍、镁、钙、锶、钡,优选镁和钙,

[0636] 卤素选自氟、氯、溴和碘,优选还选自氟、氯和溴,

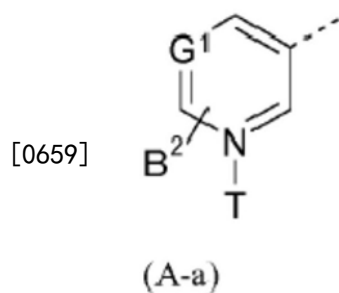
[0637] 芳基(包括作为较大单元(例如芳基烷基)的一部分的芳基)选自苯基、萘基、蒽基、菲基,并且优选还代表苯基,

[0638] 杂芳基(hetaryl)(与杂芳基(heteroaryl)同义,包括作为较大单元(例如杂芳基烷基)的一部分的杂芳基)选自呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、1,2,3-三唑基、1,2,4-三唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、1,2,3-噁二唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,5-噁二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,2,5-噻二唑基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、1,2,3-三嗪基、1,2,4-三嗪基、1,3,5-三嗪基、苯并呋喃基、苯并异呋喃基(benzoisofuryl)、苯并噻吩基、苯并异噻吩基(benzoisothienyl)、吲哚基、异吲哚基、吲唑基、苯并噻唑基、苯并异噻唑基、苯并噁唑基、苯并异噁唑基、苯并咪唑基、2,1,3-苯并噁二唑、喹啉基、异喹啉基、噌啉基、酞嗪基、喹啉基、喹喔啉基、萘啶基(naphthyridinyl)、苯并三嗪基、嘌呤基、蝶啶基和中氮茛基(indoliziny),

[0639] 杂环基代表含1个或2个氮原子和/或一个氧原子和/或一个硫原子的饱和4元、5元或6元环,例如氮杂环丁基、azolidinyl、azinanyl、氧杂环丁基(oxetanyl)、氧杂环戊基(oxolanyl)、氧杂环己基(oxanyl)、二氧杂环己基、thiethanyl、硫杂环戊基(thiolanyl)、硫杂环己基(thianyl)、四氢呋喃基、哌嗪基、吗啉基。

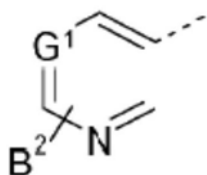
[0640] 在其组合形成优选范围(2)的特别优选的定义中,除非另有说明:

- [0641] 阳离子代表选自下述的碱金属离子:锂、钠、钾、铷、铯,优选锂、钠和钾,或
- [0642] 选自下述的碱土金属离子:铍、镁、钙、锶、钡,优选镁和钙,
- [0643] 卤素选自氟、氯、溴和碘,优选还选自氟、氯和溴,
- [0644] 芳基(包括作为较大单元(例如芳基烷基)的一部分的芳基)选自苯基、萘基、蒽基和菲基,并且优选还代表苯基,
- [0645] 杂芳基(hetaryl)(与杂芳基(heteroaryl)同义,还包括作为较大单元(例如杂芳基烷基)的一部分的杂芳基)选自吡唑基、咪唑基、1,2,3-三唑基、1,2,4-三唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、1,2,3-三嗪基、1,2,4-三嗪基、1,3,5-三嗪基,
- [0646] 杂环基选自氮杂环丁基、azolidinyl、azinanyl、氧杂环丁基、氧杂环戊基、氧杂环己基、二氧杂环己基、thiethanyl、硫杂环戊基、硫杂环己基、四氢呋喃基、哌嗪基、吗啉基。
- [0647] 在其组合形成优选范围(3)的非常特别优选的定义和尤其优选的定义中,除非另有说明:
- [0648] 阳离子代表选自下述的碱金属离子:锂、钠、钾、铷、铯,优选锂、钠、钾,或
- [0649] 选自下述的碱土金属离子:铍、镁、钙、锶、钡,优选镁和钙,
- [0650] 杂环基代表氧杂环丁基、thiethanyl、四氢呋喃基和吗啉基。
- [0651] 芳基代表苯基,
- [0652] 杂芳基(hetaryl)(与杂芳基(heteroaryl)同义,包括作为较大单元(例如杂芳基烷基)的一部分的杂芳基)代表选自如下的基团:吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、哒嗪基、噻唑基和吡唑基。
- [0653] 在形成优选范围(4)的定义中,
- [0654] 卤素代表氟、氯、溴和碘,优选还为氟、氯和溴。
- [0655] 被卤素取代的基团(例如卤代烷基)为单卤代或多卤代的,最高至可能的取代基的最大数目。在多卤代的情况下,卤素原子可以相同或不同。在此情况下,卤素代表氟、氯、溴或碘,尤其是氟、氯或溴。
- [0656] 饱和或不饱和的烃基(例如烷基或烯基)可各自为直链的或者如可行的话为支链的,包括与杂原子结合的那些,例如在烷氧基中。
- [0657] 除非另有说明,任选取代的基团可以是单取代或多取代的,其中在多取代的情况下,取代基可以相同或不同。
- [0658] 如果式(A-a)的基团A中的T代表电子对,



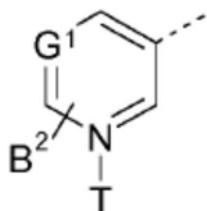
- [0660] 则所述基团以下式的吡啶衍生物的形式存在

[0661]



[0662] 如果式 (A-a) 的基团A中的T代表氧，

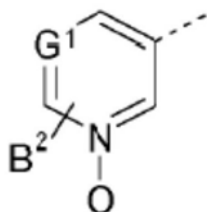
[0663]



(A-a)

[0664] 则所述基团以下式的吡啶N-氧化物衍生物的形式存在

[0665]



[0666] 此处省略了对形式电荷(氮处的+和氧处的-)的图示。

[0667] 概述性给出的或在优选范围内列出的基团定义或说明相应地适用于终产物并适用于原料和中间体。这些基团定义可按照需要彼此结合，即包括各优选范围之间的组合。

[0668] 根据本发明，优选包含以上作为优选所列出的含义的组合(优选范围(1))的式(I)化合物。

[0669] 根据本发明，特别优选包含以上作为特别优选所列出的含义的组合(优选范围(2))的式(I)化合物。

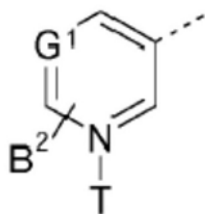
[0670] 根据本发明，非常特别优选包含以上作为非常特别优选所列出的含义的组合(优选范围(3))的式(I)化合物。

[0671] 根据本发明，尤其优选包含以上作为尤其优选所列出的含义的组合(优选范围(4))的式(I)化合物。

[0672] 根据本发明，尤其优选包含以上作为尤其优选所列出的含义的组合(优选范围(5))的式(I)化合物。

[0673] 本发明的一个优选实施方案涉及式(I)的化合物，其中A代表式(A-a)的基团

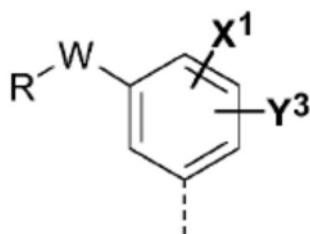
[0674]



(A-a)

- [0675] 本发明的另一个优选实施方案涉及其中A代表吡啶-3-基的式(I)化合物。
 [0676] 本发明的另一个优选实施方案涉及其中A代表5-氟吡啶-3-基的式(I)化合物。
 [0677] 本发明的另一个优选实施方案涉及其中A代表嘧啶-5-基的式(I)化合物。
 [0678] 本发明的另一个优选实施方案涉及其中A代表哒嗪-4-基的式(I)化合物。
 [0679] 本发明的另一个优选实施方案涉及其中R²具有a)给出的含义的式(I)化合物。
 [0680] 本发明的另一个优选实施方案涉及其中R²具有b)给出的含义的式(I)化合物。
 [0681] 本发明的另一个优选实施方案涉及其中R²具有c)给出的含义的式(I)化合物。
 [0682] 本发明的另一个优选实施方案涉及其中R²具有d)给出的含义的式(I)化合物。
 [0683] 本发明的另一个优选实施方案涉及其中R²具有e)给出的含义的式(I)化合物。
 [0684] 本发明的另一个优选实施方案涉及其中R²具有f)给出的含义的式(I)化合物。
 [0685] 本发明的另一个优选实施方案涉及式(I)的化合物,其中R²代表基团(D-2)

[0686]

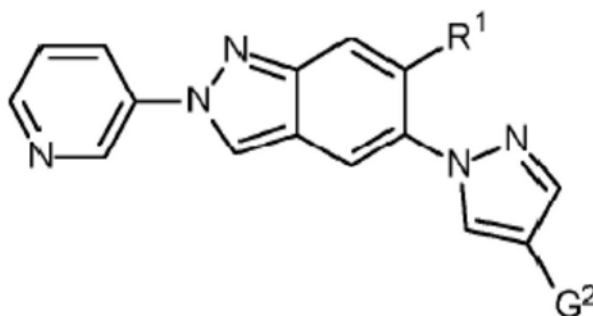


(D-2)

[0687] 以上概述性地或在优选范围内给出的基团定义或说明相应地适用于终产物(包括稍后示出的式(I-A)至(I-N)的化合物)并且适用于原料和中间体。这些基团定义可按照需要彼此组合,即包括各优选范围之间的组合。

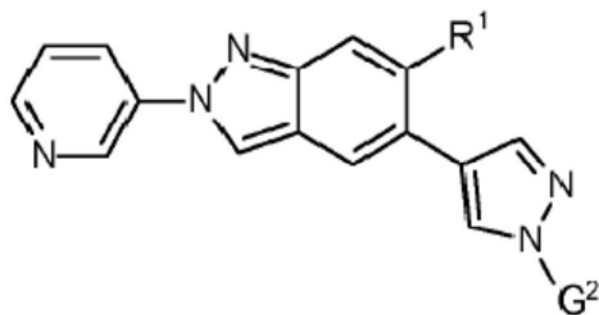
[0688] 在一个优选实施方案中,本发明涉及式(I-A)的化合物

[0689]



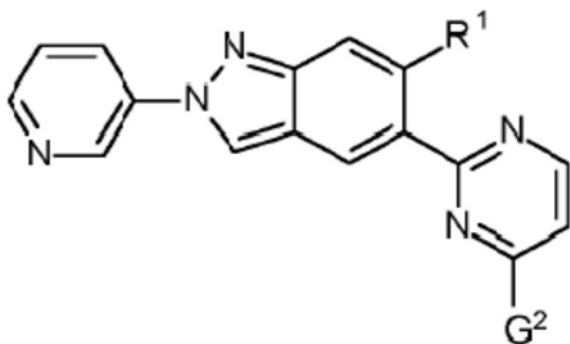
[0690] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式(I-B)的化合物

[0691]



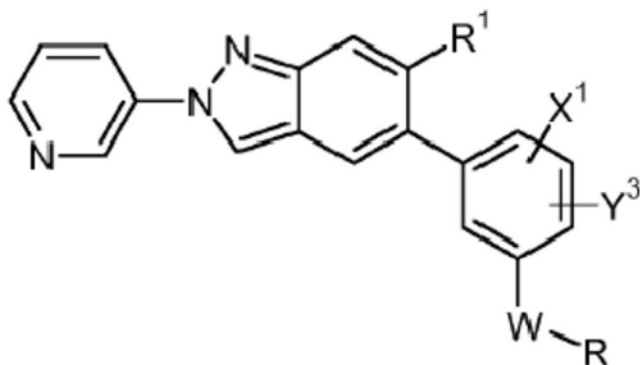
[0692] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式 (I-C) 的化合物

[0693]



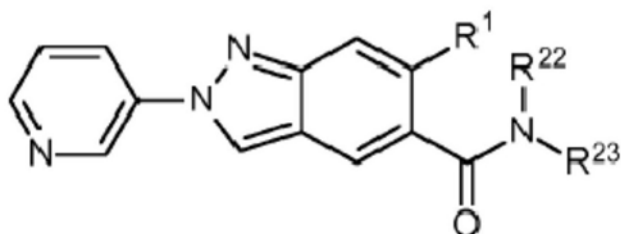
[0694] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式 (I-D) 的化合物

[0695]



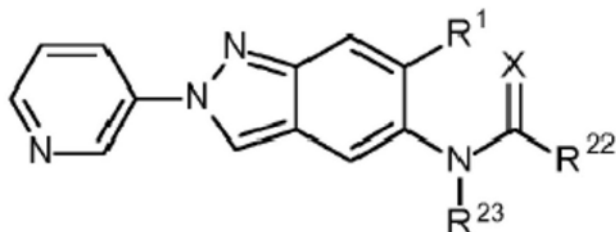
[0696] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式 (I-E) 的化合物

[0697]



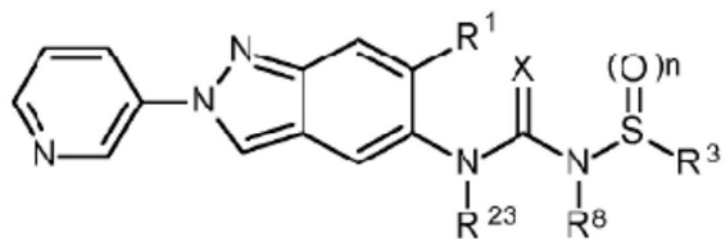
[0698] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式 (I-F) 的化合物

[0699]



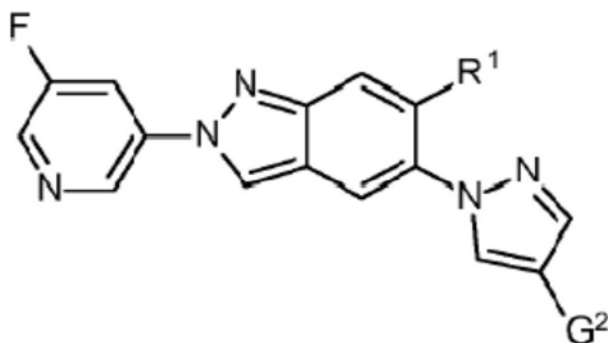
[0700] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式 (I-G) 的化合物

[0701]



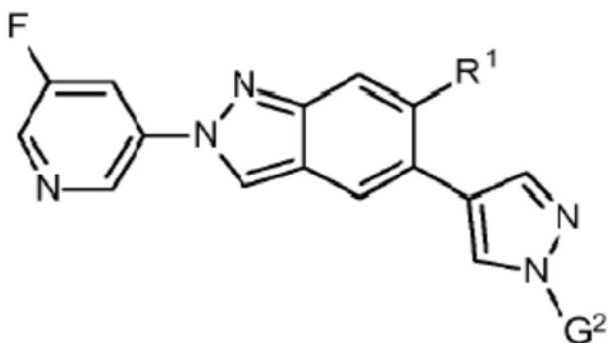
[0702] 在一个优选实施方案中,本发明涉及式 (I-H) 的化合物

[0703]



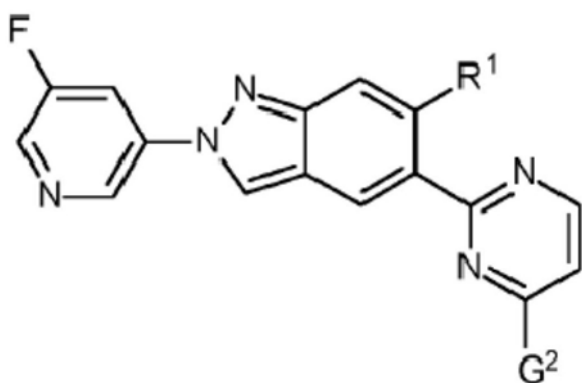
[0704] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式 (I-I) 的化合物

[0705]



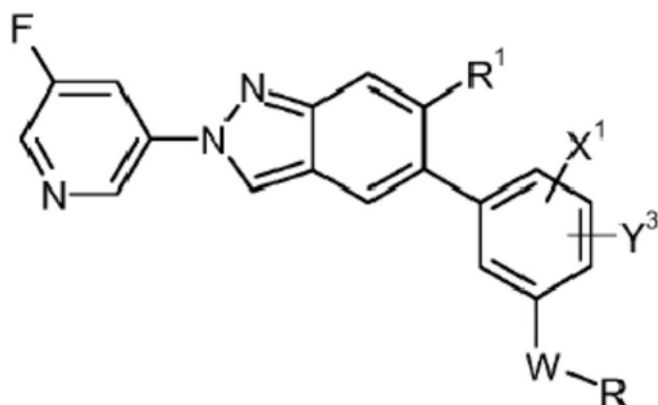
[0706] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式 (I-J) 的化合物

[0707]



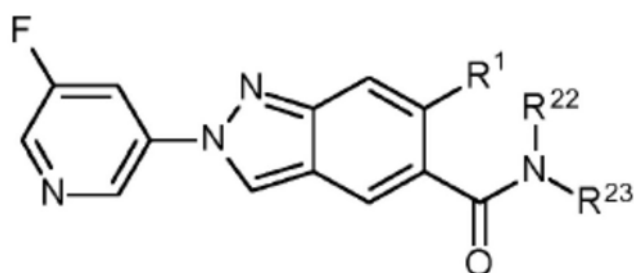
[0708] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式 (I-K) 的化合物

[0709]



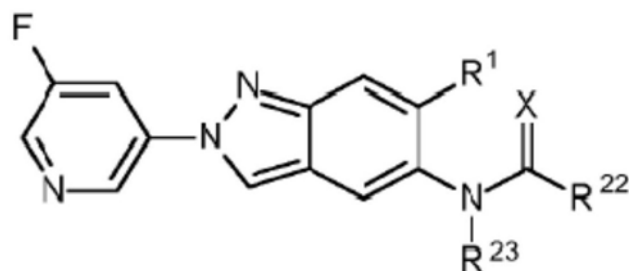
[0710] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式 (I-L) 的化合物

[0711]



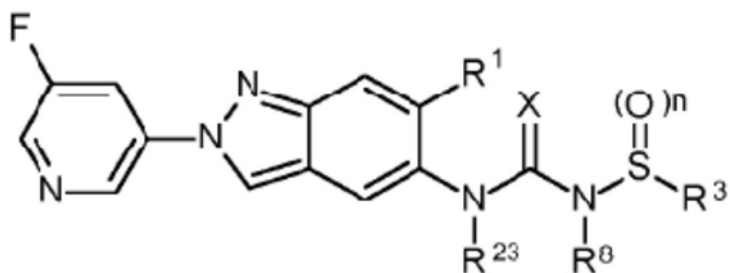
[0712] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式 (I-M) 的化合物

[0713]



[0714] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式 (I-N) 的化合物

[0715]



[0716] 在式 (I-A) 至 (I-N) 中,变量具有上文进一步述及的含义。

[0717] 本发明的式 (I) 的化合物及其酸加成盐和金属盐络合物具有高的活性,特别是在防治动物害虫(包括节肢动物且特别是昆虫)方面。

[0718] 根据取代基的性质,式 (I) 的化合物还可为立体异构体的形式,即几何异构体和/或光学异构体或具有不同组成的异构体混合物的形式。本发明提供纯的立体异构体和这些异构体的任何所需混合物,尽管在本文中通常仅讨论式 (I) 的化合物。

[0719] 因此,本发明涉及用于防治动物害虫(包括节肢动物且特别是昆虫)的纯的对映异构体和非对映异构体及其混合物。

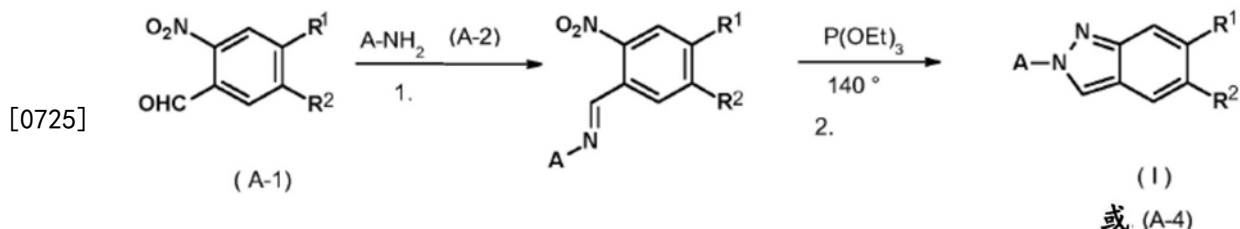
[0720] 然而,本发明优选使用光学活性的立体异构形式的式(I)的化合物及其盐。

[0721] 可提及的式(I)化合物的合适的盐为常规的无毒盐,即与适当的碱形成的盐和与添加的酸形成的盐。优选与无机碱形成的盐,例如碱金属盐(如钠盐、钾盐或铯盐)、碱土金属盐(如钙盐或镁盐)、铵盐;与有机碱和无机胺形成的盐,例如三乙铵盐、二环己基铵盐、N,N'-二苄基乙二铵盐、吡啶盐、甲基吡啶鎓盐或乙醇铵盐;与无机酸形成的盐,例如盐酸盐、氢溴酸盐、硫酸二氢盐(dihydrosulphate)、硫酸三氢盐(trihydrosulphate)或磷酸盐;与有机羧酸或有机磺酸形成的盐,例如甲酸盐、乙酸盐、三氟乙酸盐、马来酸盐、酒石酸盐、甲磺酸盐、苯磺酸盐或对甲苯磺酸盐;与碱性氨基酸形成的盐,例如精氨酸盐、天冬氨酸盐或谷氨酸盐等。

[0722] 此外,已发现式(I)的化合物以及表1中的未包括在式(I)中的化合物可通过下述方法制备。

[0723] 例如,可以根据反应方案I以两步法制备式(I)的化合物,其中杂环A代表任选地被B²取代的嘧啶-5-基(A-a;G¹=N)、吡啶-3-基(A-a;G¹=C-B¹)、吡嗪-2-基(A-b)、哒嗪-3-基(A-c)、噻唑-5-基(A-d)、异噻唑-4-基(A-e)和吡唑-4-基(A-f)。

[0724] 反应方案I



[0726] 在反应方案I中,A、R¹和R²具有以上所述的含义,除非另外指出。

[0727] 例如,在第一反应步骤中,在酸性反应助剂的存在下,可使式(A-1)的取代的2-硝基苯甲醛与相应的式(A-2)的3-氨基取代的杂环反应,得到式(A-3)的化合物,然后在第二反应步骤中,在合适的磷(III)试剂(例如亚磷酸三乙酯)的存在下,对其进行还原环化,形成化合物(A-4)。

[0728] 在本发明的制备式(I)的化合物的方法中,如果使用的式(A-1)的化合物为2-硝基-5-(三氟甲基)苯甲醛(R¹=H,R²=CF₃)且使用的式(A-2)的化合物为3-吡啶胺(A=吡啶-3-基),则首先形成N-[(2-硝基-5-三氟甲基苯基)亚甲基]-3-吡啶胺(A=吡啶-3-基,R¹=H,R²=CF₃)。然后,后续的还原和环化产生5-三氟甲基-2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑(A-4,A=吡啶-3-基,R¹=H,R²=CF₃) (参见制备实施例6和16)。

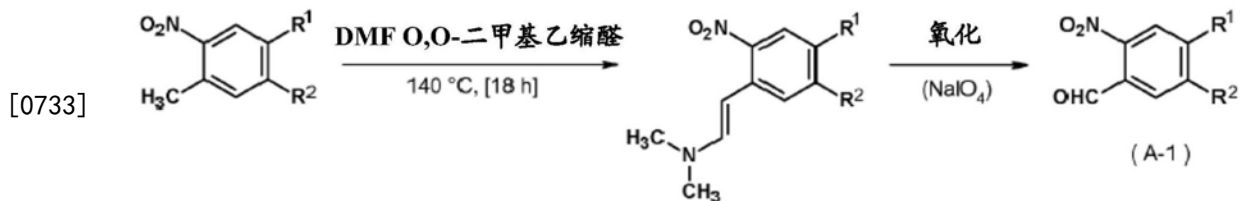
[0729] 偶氮甲碱衍生物或氨基取代的杂环的所谓的“席夫碱(Schiff base)”具有多种应用(其例如形成金属络合物或具有生物活性),并且可通过常规方法获得(同样参见V.Shama等,Intern.J.Univ.Pharm.Bio Science 2013,2,241-57及其中所引用的文献)。

[0730] 一些式(A-1)的化合物是已知的并且市售可得,和/或原则上其可以通过已知的制备方法来制备(对于R¹=H,R²=Br;5-溴-2-硝基苯甲醛(WO 2014/121416 A1);对于R¹=OCH₃,R²=Br;5-溴-4-甲氧基-2-硝基苯甲醛(WO 2008/079988 A2);对于R¹=H,R²=COOCH₃;3-甲酰基-4-硝基苯甲酸甲酯(WO 2007/087129 A2);对于R¹=OCH₃,R²=NH₂;5-氨基-4-甲氧基-2-硝基苯甲醛(X.Han等,Chem.Eur.J.2007,13(28),7957-7964))。

[0731] 例如,2-硝基-5-三氟甲基苯甲醛(R¹=H,R²=CF₃)可根据反应方案II由2-甲基-1-

硝基-4-三氟甲基苯经N,N-二甲基甲酰胺O,O-二甲基乙缩醛反应及后续的高碘酸钠氧化来合成(参见制备实施例)。

[0732] 反应方案II



[0734] 一些式(A-2)的化合物是已知的并且市售可得,和/或原则上其可通过已知的制备方法来制备,参见例如,对于A=5-氟吡啶-3-基(A-a;B²=H,G¹=C-F;T=电子对)(WO 2011/123751 A2);吡嗪-2-基(A-b;B²=H)(WO 2012/151567 A1);哒嗪-4-基(A-c;B²=H)(WO 2011/038572 A1);噻唑-5-基(A-d;B²=H)(JP 4600 6049 B4);异噻唑-4-基(A-e;B²=H)(US 2839529);或1-甲基-1H-吡唑-4-基(A-f;B²=H,R³=CH₃)。

[0735] 式(A-3)的化合物可通过所述制备方法的步骤1获得,或通过原则上已知的合成方法获得,参见例如,对于A=吡啶-3-基(A-a;B²=H,G¹=CH;T=电子对;R¹、R²=H)(S.Ostrowski,A.M.Wolniewicz,Chem.Het.Comp.(New York)(Transl.Khim.Geterotsikl.Soedin.)2000,36(6),705-713);或对于A=噻唑-2-基(A-b;B²、R¹、R²=H)(A.L.El-Ansary等,Egypt.J.Chem.1991,33(2),129-145)。

[0736] 最后,式(I)的化合物可由所述制备方法的步骤2,在亚磷酸三乙酯的存在下通过通式(A-3)的邻亚氨基硝基苯的还原环化(例如通过Candogan吡啶合成)(参见J.I.G.Candogan等,J.Chem.Soc.1965,4831)而获得。

[0737] 或者,还可以采用经调节的Candogan等的还原环化反应条件,或采用可替代的反应条件,例如亚氨基硝基芳族化合物的过渡金属催化还原环化和2-叠氮基亚胺的热过渡金属催化环化(参见N.E.Genung等,Org.Lett.2014,16,3114-3117及其中所引用的文献)。

[0738] 此外,还已知多种其他方法,例如:邻硝基苄胺的还原环化(F.Sun等,Tetrahedron 2012,68,3851)、分子内氨基化反应(J.J.Song,N.K.Yee,Org.Lett.2000,2,519)或酰化偶氮苯环化(H.Li等,Chem.Commun.2013,49,9170)。然而,就广度、使用过渡金属催化剂和中间体(其中一些为高能耗的)而言,这些方法在高温下的使用受限。

[0739] 在磷(III)试剂的存在下,底物(A-3)中的硝基首先被还原形成这样的硝基:其随后形成氮宾(nitrene)或类氮宾中间体,然后引起分子内环化(参见N.E.Genung等,Org.Lett.2014,16,3114-3117)。另外的研究证实,除亚磷酸三乙酯外,还可以使用三环己基膦、三(正丁基)膦或三(叔丁基)膦(M.-A.Armour等,J.Chem.Soc.,Perkin Trans.2 1975,1185-1189;N.E.Genung等,Org.Lett.2014,16,3114-3117)作为替代的磷(III)试剂。

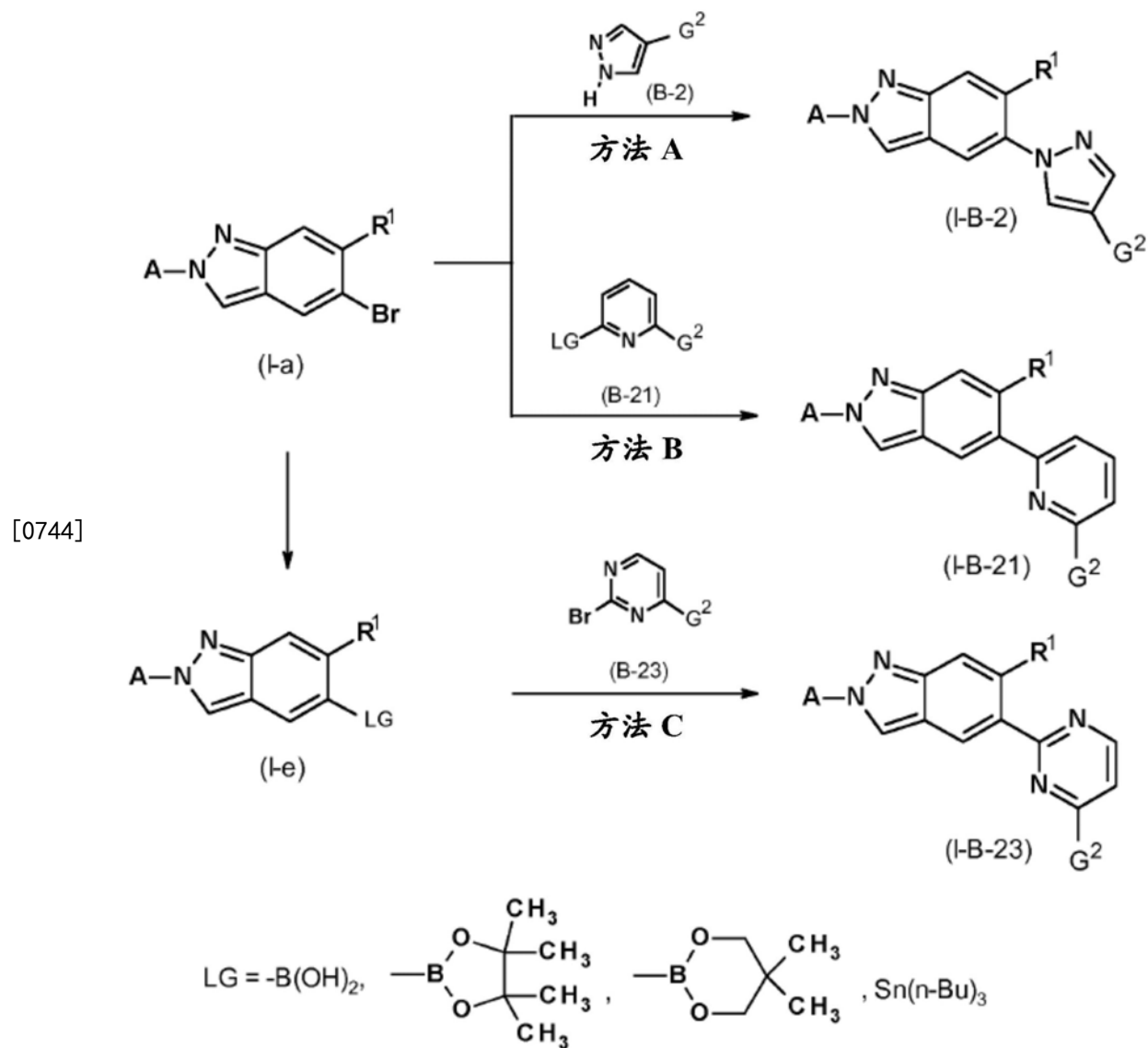
[0740] 其中A、R¹具有上文进一步所述的含义且R²代表选自(B-1)至(B-34)的基团的式(I)的化合物,可例如由其中R²优选代表选自溴和碘的卤素的式(I)的化合物,通过普遍已知的方法(方法A:参见J.C.Antilla等,J.Org.Chem.,2004,69,5578-5587,以及方法B:参见H.Dong等,Org.Lett.,2011,13,2726-2729;Ch.O.Ndubaku等,J.Med.Chem.,2013,56,4597-4610;T.Furuya等,J.Am.Chem.Soc.,2010,132,3793-3807)来制备。

[0741] 其中R²代表卤素(例如溴或碘)的式(I)的化合物可根据反应方案I由相应的卤代

2-硝基苯甲醛 (A-1) 获得。

[0742] 例如, 其中 R^2 代表基团 (B-2)、(B-21) 或 (B-23) 的式 (I) 的化合物可根据反应方案 III 获得 (还参见制备实施例, (I-B-2) / 方法 A: A=吡啶-3-基; $R^1=H$, $G^2=CF_3$, 实施例 55 和 (I-B-21) / 方法 B: A=吡啶-3-基; $R^1, G^2=H$; 实施例 59)。

[0743] 反应方案 III



[0745] 在反应方案 III 中, 化合物 (I-e) 和其中 G^2 具有上文进一步所述含义的 (B-21) 具有任选原位生成的离核离去基团 LG。

[0746] 其中 R^2 代表基团 (B-1)、(B-2)、(B-10)、(B-29) 或 (B-30) 的式 (I) 的化合物的制备可以类似于方法 A (由文献已知), 优选在碘化亚铜 (I) 和碱性反应助剂 (例如反式-N,N'-二甲基环己烷-1,2-二胺和碳酸钾) 的存在下, 在合适的溶剂或稀释剂中进行。有用的溶剂或稀释剂包括所有的惰性有机溶剂, 例如脂族烃或芳族烃。

[0747] 优选使用芳族烃, 例如甲苯。

[0748] 其中 R^2 代表基团 (B-3) 至 (B-9)、(B-11) 至 (B-28) 和 (B-31) 至 (B-33) 的式 (I) 的化合物的制备可类似于反应方案 III 中所示的方法 B 和 C 来进行。

[0749] 例如, 具有合适的离去基团 ($LG=B(OH)_2$) 或 (杂) 芳基硼酸酯 ($LG=B(OR)_2$) 的化合

物(B-3)至(B-9)、(B-11)至(B-28)和(B-31)至(B-33)根据已知方法(参见Chem.Rev.1995, 95,2457-2483;Tetrahedron2002,58,9633-9695;Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions(编辑:A.de Meijere,F.Diederich),第2版,Wiley-VCH,Weinheim,2004),在选自过渡金属盐的合适催化剂的存在下可与适当的式(I-a)的化合物反应,得到式(I-B-3)至(I-B-9)、(I-B-11)至(I-B-28)和(I-B-31)至(I-B-33)的化合物。

[0750] 具有合适的离去基团($LG=B(OH)_2$)或(杂)芳基硼酸酯($LG=B(OR)_2$)的化合物(B-3)至(B-9)、(B-11)至(B-13)和(B-21)至(B-33)中的一些是已知的,和/或其可通过已知的方法制备:例如,1-(甲基-1H-吡唑-4-基)硼酸[(B-3), $LG=B(OH)_2$, $G^2=H$,WO 2009/155527];2-苯基-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂硼杂环戊烷-2-基)噁唑[(B-6), $LG=B(OCMe_2)_2$, $G^2=H$,WO 2010/094755];噁唑-2-基硼酸[(B-7), $LG=B(OH)_2$, $G^2=H$,US 6310095B1];5-苯基-1,2,4-噁二唑-3-基硼酸[(B-13), $LG=B(OH)_2$, $G^2=H$,DE 19710614 A1];吡啶-3-基硼酸[(B-21)对(B-22), $LG=B(OH)_2$, $G^2=H$,WO 2013/186089];1,3,5-三嗪-2-基硼酸[(B-28), $LG=B(OH)_2$, $G^2=H$,Korean Kongkae Taeho Kongbo(2011),KR 2011/079401]。

[0751] 或者,首先可通过由文献已知的方法将式(I-a)的化合物转化为式(I-e)的化合物,然后根据反应方案III通过方法C使其与卤素-活化的杂环进一步反应(参见T.Ishiyama等,J.Org.Chem.,1995,60,7508-7510;WO 2010/151601);(参见制备实施例,(I-B-23)/方法C:A=吡啶-3-基; $R^2=$ 噁唑-2-基; $R^1,G^2=H$;实施例60)。

[0752] 一些卤素-活化的化合物(B-3)至(B-9)、(B-11)至(B-13)和(B-21)至(B-33)是已知的,和/或其可通过通常已知的方法制备:例如3-溴-4,5-二氢-1-苯基-1H-吡唑[(B-18), $LG=Br$, $G^2=H$,J.Elguero等,Bull.Soc.Chim.France 1996,5,1683-1686]。

[0753] 其中 R^2 代表基团(B-21)或(B-23)的式(I)的化合物的制备可以类似于由文献已知且示于反应方案III中的方法B和C,优选在合适的偶联催化剂、碱性反应助剂的存在下且在合适的溶剂或稀释剂中进行。有用的溶剂或稀释剂包括所有的惰性有机溶剂,例如脂族烃或芳族烃。

[0754] 优选使用芳族烃,例如甲苯。

[0755] 其中 R^2 代表基团(B-3)至(B-9)、(B-11)至(B-28)和(B-31)至(B-33)的式(I)的化合物的制备可以类似于示于反应方案III中的方法B和C,优选在合适的偶联催化剂、碱性反应助剂的存在下且在合适的溶剂或稀释剂中进行。

[0756] 优选的偶联催化剂的实例包括钯催化剂,如[1,1'-二(二苯基膦)二茂铁]二氯化钯(II)或四(三苯基膦)钯。

[0757] 用于进行反应方案III的方法的合适的碱性反应助剂优选为碳酸钠或碳酸钾。

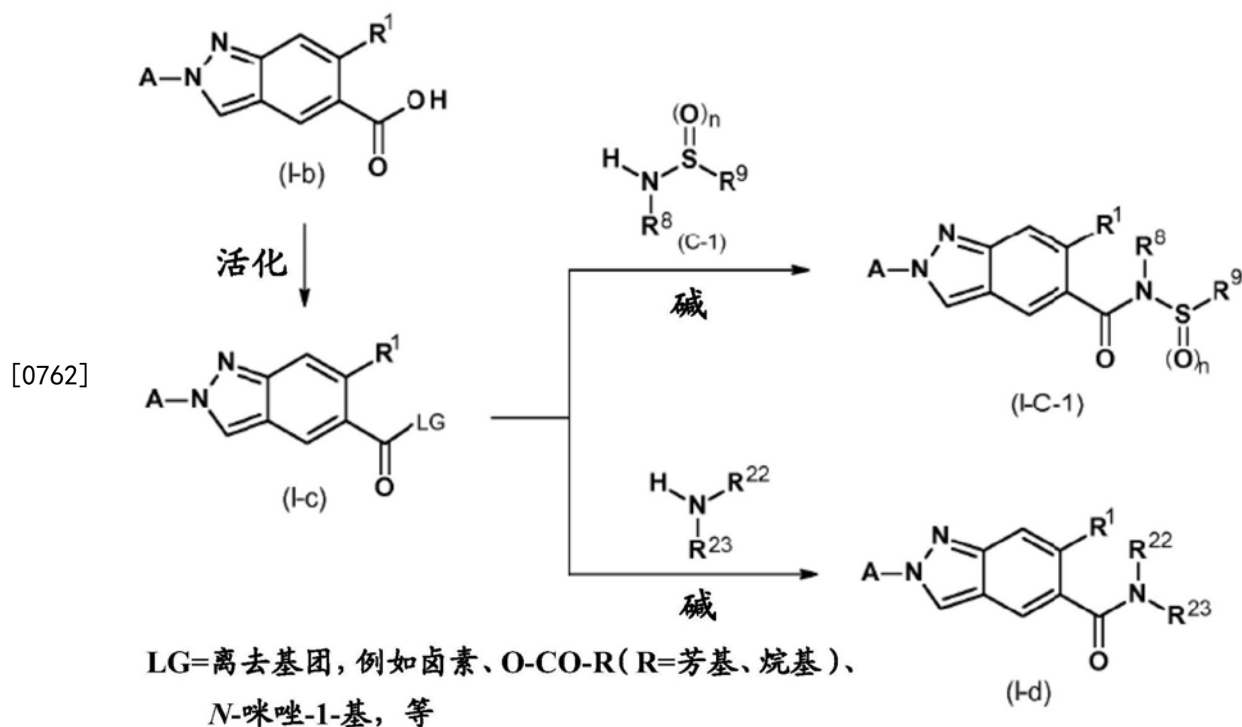
[0758] 优选地,所使用的稀释剂为腈,例如乙腈、苄腈,特别是乙腈;或醚,例如乙醚、二氧杂环己烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷,特别是1,2-二甲氧基乙烷与水的组合。

[0759] 其中 R^2 代表选自(C-1)至(C-9)的基团或代表 $C(X)NR^{22}R^{23}$ 的式(I)的化合物可通过已知的方法,例如由其中 R^2 代表羧基的式(I)的化合物,随后适当活化(即LG代表任选原位生成的离核离去基团)而制备。

[0760] 例如,其中 R^2 代表基团(C-1)或代表 $C(X)NR^{22}R^{23}$ 的式(I)的化合物可根据反应方案IV而获得(还参见制备实施例,(I-C-1):A=吡啶-3-基或N-甲基吡唑-4-基; $R^1,R^8=H$, $R^9=N$

(CH₃)₂, n=2; 实施例5和42; (I-d): A=吡啶-3-基或嘧啶-5-基; R¹=H, R²²、R²³=CH₃, 实施例1和27)。

[0761] 反应方案IV



[0763] 其中R²代表羧基的式(I)的化合物可根据反应方案I由相应的3-甲酰基-4-硝基苯甲酸烷基酯(A-1; R²=COOR)获得。然后, 通过常规方法进行酯水解, 产生式(I-b)的化合物。

[0764] 用于活化式(I-b)的羧酸的合适的缩合剂为通常用于这种酰胺化反应的所有缩合剂。实例包括: 酰卤形成物, 例如光气、光气衍生物如羰基二咪唑(CDI)、三氯化磷、草酰氯或亚硫酰氯; 碳二亚胺, 例如N,N'-二环己基碳二亚胺(DCC)和1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳二亚胺(EDCI); 或其他常规缩合剂, 例如五氧化二磷、多磷酸、N,N'-羰基二咪唑、2-氯吡啶1-甲基碘化物(Mukaiyama试剂)、2-乙氧基-N-乙氧基羰基-1,2-二氢喹啉(EEDQ)、三苯基磷/四氯化碳、溴代三吡咯烷磷六氟磷酸盐(BROP)、O-(1H-苯并三唑-1-基氧基)三(二甲基氨基)磷六氟磷酸盐(BOP)、二(2-氧代-3-噁唑烷基)次磷酰氯(BOP-Cl)、N,N,N',N'-二(四亚甲基)脒鎓四氟硼酸盐、O-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脒鎓六氟磷酸盐(HBTU)、O-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-二(四亚甲基)脒鎓六氟磷酸盐、O-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脒鎓四氟硼酸盐(TBTU)、O-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-二(四亚甲基)脒鎓四氟硼酸盐、O-(7-氮杂苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脒鎓六氟磷酸盐(HATU)、1-羟基苯并三唑(HOBt)和4-(4,6-二甲氧基-1,3,5-三嗪-2-基)-4-甲基吗啉鎓盐(DMT.MM), 通常以氯化物形式购得。这些试剂可以单独使用, 或如果合适, 还可以组合使用。

[0765] 然而, 对于式(I-b)的化合物的定向活化, 还可使用混合酸酐(LG=COOR), 这导致制备式(I-C-1)和(I-d)的化合物(参见G.W.Anderson等, J.Am.Chem.Soc.1967, 89, 5012-5017)。在该方法中, 可使用多种氯甲酸酯, 例如氯甲酸异丁酯(LG=COOR, 其中R=异丁基)和氯甲酸异丙酯(LG=COOR, 其中R=异丙基)。为此, 还可以使用二乙基乙酰氯、三甲基乙酰

氯等。

[0766] 根据反应方案IV,式(I-c)的活化化合物与相应的胺组分的后续反应任选在合适的反应助剂的存在下且在合适的溶剂或稀释剂的存在下进行。

[0767] 用于进行反应方案IV的方法的合适的反应助剂为碱性反应助剂。

[0768] 可提及的实例是锂、钠、钾、镁、钙和钡的氢氧化物、氢化物、氧化物和碳酸盐,此外还有碱性化合物,例如脒碱或胍碱,如7-甲基-1,5,7-三氮杂双环[4.4.0]癸-5-烯(MTBD)、二氮杂双环[4.3.0]壬烯(DBN)、二氮杂双环[2.2.2]辛烷(DABCO)、1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳烯(DBU)、环己基四丁基胍(CyTBG)、环己基四甲基胍(CyTMG)、N,N,N,N-四甲基-1,8-萘二胺、五甲基哌啶;叔胺,如三乙胺、三甲胺、三苄胺、三异丙胺、三丁胺、三环己胺、三戊胺、三己胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基甲苯胺、N,N-二甲基对氨基吡啶、N-甲基吡咯烷、N-甲基哌啶、N-甲基咪唑、N-甲基吡唑、N-甲基吗啉、N-甲基六亚甲基二胺、吡啶、4-吡咯烷基吡啶、4-二甲基氨基吡啶、喹啉、 α -甲基吡啶、 β -甲基吡啶、异喹啉、嘧啶、吡啶、N,N,N',N'-四亚甲基二胺、N,N,N',N'-四亚乙基二胺、喹喔啉、N-丙基二异丙胺、N-乙基二异丙胺(“Hünig's碱”)、N,N'二甲基环己胺、2,6-二甲基吡啶、2,4-二甲基吡啶或三乙基二胺。

[0769] 适于用作用于进行反应方案IV的方法的碱性反应助剂为所有合适的缚酸剂(例如胺,特别是叔胺)以及碱金属和碱土金属化合物。

[0770] 为了制备式(I-C-1)或(I-d)的化合物,优选使用叔胺如N-丙基二异丙胺或N-乙基二异丙胺(DIEA;Hünig碱)。

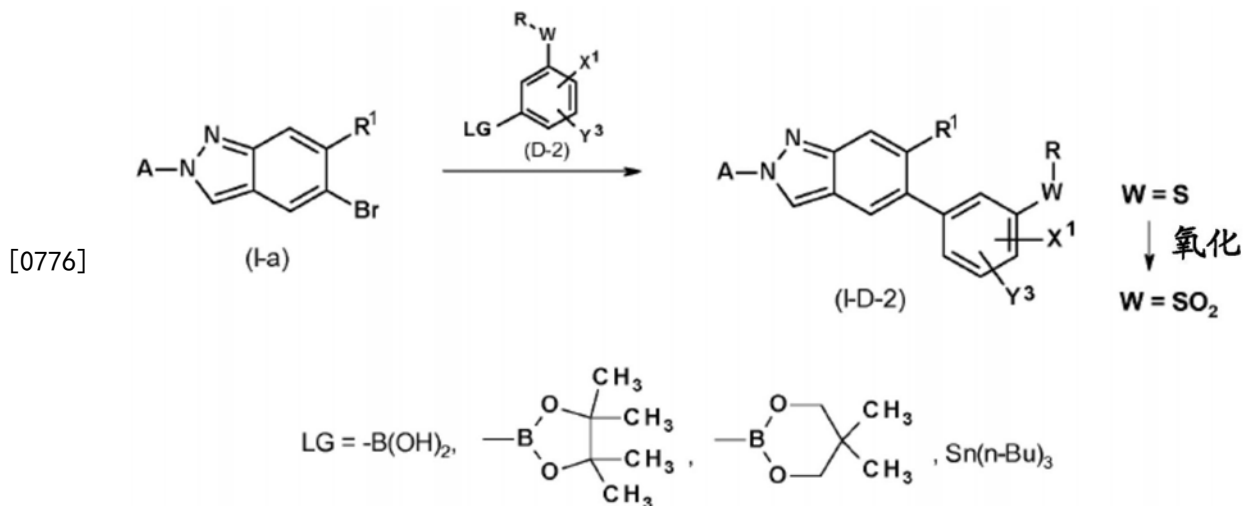
[0771] 合适的溶剂或稀释剂包括所有的惰性有机溶剂,例如脂族烃或芳族烃(如石油醚、甲苯)、卤代烃(如氯甲苯、二氯甲烷、氯仿、1,2-二氯乙烷)、醚(如乙醚、二氧杂环己烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷)、酯(如乙酸乙酯或乙酸甲酯)、硝基烃(如硝基甲烷、硝基乙烷、硝基苯)、腈(如乙腈、苄腈)、酰胺(如N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基甲酰苯胺、N-甲基吡咯烷酮、六甲基磷酰胺)以及二甲基亚砷或水或所述溶剂的混合物。

[0772] 优选使用酰胺作为溶剂,例如N,N-二甲基甲酰胺。

[0773] 其中R²代表选自(D-1)至(D-3)的基团的式(I)的化合物可例如通过已知的方法,由其中R²代表选自溴和碘的卤素的式(I)的化合物来制备。

[0774] 例如,其中R²代表选自(D-1)至(D-3)的基团的式(I)的化合物可根据反应方案V通过由文献已知的方法获得(参见US2013/0267493;T.Furuya等,J.Am.Chem.Soc.,2010,132,3793-3807)(还参见制备实施例,(I-D-2):A=吡啶-3-基;R=CH₂CF₃,R¹=H,W=S,X¹=2-F,Y³=4-CH₃)。

[0775] 反应方案V



[0777] 在反应方案V中,其中R、X¹、Y³具有上文所述的含义且W代表S、SO或SO₂的化合物(D-2)具有任选原位生成的离核离去基团LG。

[0778] 例如,具有合适的离去基团(LG=B(OH)₂)或(杂)芳基硼酸酯(LG=B(OR)₂)的化合物(D-1)至(D-3)可与合适的式(I-a)的化合物根据已知的方法(参见Chem.Rev.1995,95,2457-2483;Tetrahedron2002,58,9633-9695;Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions(编辑:A.de Meijere,F.Diederich),第2版,Wiley-VCH,Weinheim,2004),在选自过渡金属盐的合适催化剂的存在下反应,得到式(I-D-1)至(I-D-3)的化合物。

[0779] 其中R²代表基团(D-1)至(D-3)的式(I)的化合物的制备可以类似于反应方案V,优选在合适的偶联催化剂、碱性反应助剂的存在下且在合适的溶剂或稀释剂中进行。

[0780] 优选的偶联催化剂的实例包括钯催化剂,如[1,1'-二(二苯基膦基)二茂铁]二氯化钯(II)或四(三苯基膦)钯。

[0781] 用于进行反应方案III的方法的合适的碱性反应助剂优选为碳酸钠或碳酸钾。

[0782] 优选使用腈,例如乙腈、苄腈,特别是乙腈;或醚,例如乙醚、二氧杂环己烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷,特别是1,2-二甲氧基乙烷与水的组合。

[0783] 其中A、R、R¹、X¹、Y³具有上文所述的含义且W代表硫的式(I-D-2)的化合物中的硫的后续氧化产生其中A、R、R¹、X¹、Y³具有上文所述的含义且W代表SO或SO₂的式(I-D-2)的化合物(参见反应方案V;参见制备实施例,(I-D-2):A=吡啶-3-基;R=CH₂CF₃,R¹=H,W=SO,X¹=2-F,Y³=4-CH₃;参见实施例52,或A=吡啶-3-基;R=CH₂CF₃,R¹、X¹=H,W=SO,Y³=4-CH₃;参见实施例53)。

[0784] 其中W代表SO (亚砷) 或W代表SO₂ (砷) 的式 (I) 的化合物可以由其中W代表S (硫醚) 的式 (I) 的化合物通过由文献已知的方法进行氧化, 例如在合适的溶剂或稀释剂中通过氧化剂来制备。合适的氧化剂为, 例如稀硝酸、过氧化氢、**Oxone**[®] 和过氧羧酸 (例如间氯过氧苯甲酸)。合适的溶剂或稀释剂为惰性有机溶剂, 通常为乙腈和卤代溶剂 (例如二氯甲烷、氯仿或二氯乙烷), 以及水和醇 (例如用于与**Oxone**[®] 反应的甲醇)。

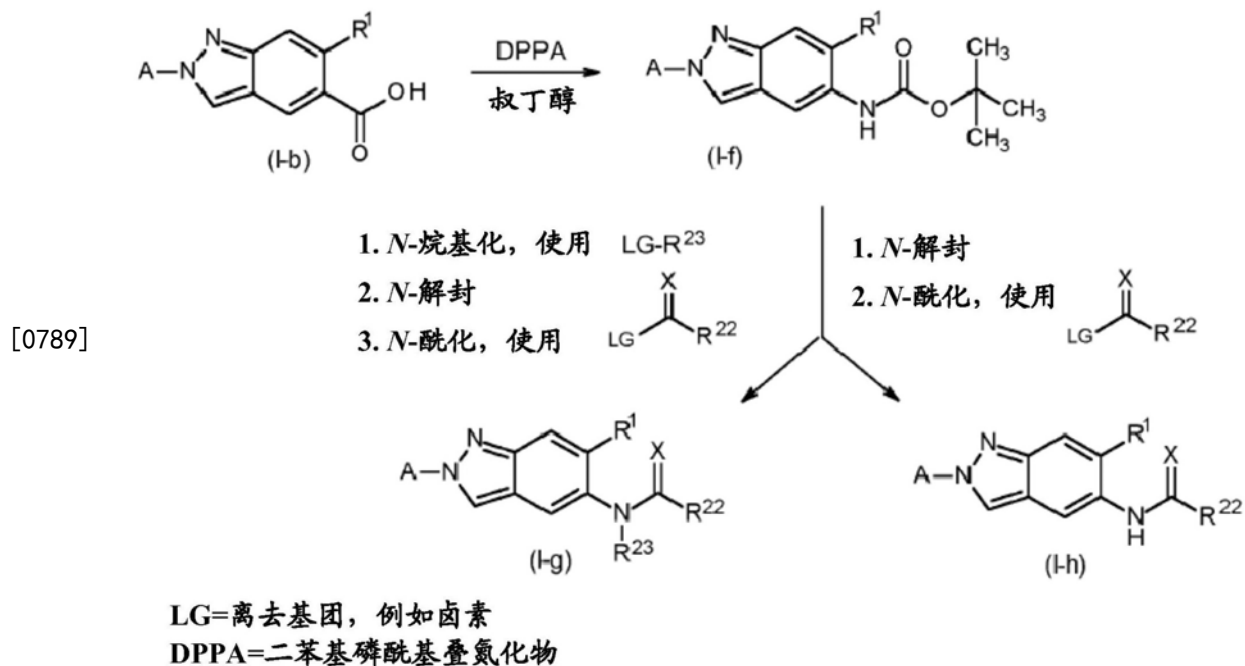
[0785] 多种方法适用于制备富含对映异构体的亚砷,如由G.E.O' Mahony等在ARKIVOC (Gainesville,FL,United states),2011,1,1-110中所记载:例如使用以Ti(OⁱPr₄)或VO(acac)₂的形式的钛或钒作为最常用的催化剂来源,连同手性配体和氧化剂(如叔丁基氢过氧化物(TBHP)、2-苯基丙-2-基氢过氧化物(CHP)或过氧化氢)对硫醚进行的金属催化的不

对称氧化;使用手性氧化剂或手性催化剂的非金属催化的不对称氧化;电化学或生物学不对称氧化;以及亚砷的动力学拆分和亲核取代(根据Andersen方法)。

[0786] 其中A、R¹具有上文所述的含义且R²代表-NR²³-C(X)-R²²的式(I)的化合物可以例如由其中R²代表-NHR²³的式(I)的化合物,通过使用式LG-CX-R²²(其中LG代表任选原位生成的离核离去基团)的活化化合物进行N-酰化反应而获得。

[0787] 这些其中R²代表-NHR²³的式(I)的化合物可由其中R²代表羧基的式(I)的化合物根据反应方案VI通过已知的方法制备。

[0788] 反应方案VI



[0790] 例如,式(I-f)的化合物可以通过例如在Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie[Methods of Organic Chemistry],第XI/1卷(Georg Thieme Verlag Stuttgart),第865页中所记载的Curtius降解来获得。

[0791] 此处,式(I-b)的化合物可例如在叔丁醇的存在下与二苯基磷酰基叠氮化物(DPPA)直接反应,得到式(I-f)的化合物。

[0792] 由式(I-f)的化合物通过在第一反应步骤中进行N-烷基化、在第二反应步骤中进行N-解封(即裂解Boc基团)以及随后在第三反应步骤中进行N-酰化,可获得式(I-g)的化合物。

[0793] 式(I-h)的化合物可以通过在第一反应步骤中进行N-解封(即裂解Boc基团)以及随后在第二反应步骤中进行N-酰化来制备(参见实施例105至130)。

[0794] 通常,为了除去保护基团,可根据由文献已知的方法使用酸性或碱性反应助剂。当使用氨基甲酸酯类的保护基团时,优选使用酸性反应助剂。当使用氨基甲酸叔丁酯保护基团(Boc基团)时,使用例如无机酸(如盐酸、氢溴酸、硝酸、硫酸、磷酸)或有机酸(如苯甲酸、甲酸、乙酸、三氟乙酸、甲磺酸、苯磺酸或甲苯磺酸)在合适的稀释剂(如水和/或有机溶剂如四氢呋喃、二氧杂环己烷、二氯甲烷、氯仿、乙酸乙酯、乙醇或甲醇)中的混合物。优选盐酸或乙酸与水或有机溶剂如乙酸乙酯的混合物。

[0795] 下文中,如果涉及式(I)的化合物,则其还包括表1中的未包括在式(I)中的那些化

合物。

[0796] 异构体

[0797] 根据取代基的性质,式(I)的化合物可以为几何异构体和/或光学活性异构体或具有不同组成的相应异构体的混合物的形式。这些立体异构体是,例如对映异构体、非对映异构体、阻转异构体或几何异构体。因此,本发明包括纯立体异构体和这些异构体的任何混合物。

[0798] 方法和用途

[0799] 本发明还涉及防治动物害虫的方法,其中使式(I)的化合物作用于动物害虫和/或其生境。动物害虫的防治优选在农业和林业中以及在材料保护中进行。这优选排除了用于人体或动物体的外科手术或治疗性处理的方法以及在人体或动物体上进行的诊断方法。

[0800] 本发明还涉及式(I)的化合物作为农药、尤其是作物保护剂的用途。

[0801] 在本申请的上下文中,术语“农药”还总是包括术语“作物保护剂”。

[0802] 式(I)的化合物——具有良好的植物耐受性、对温血动物有利的毒性和良好的环境相容性——适用于保护植物和植物器官抵抗生物和非生物胁迫因素;增加采收产量;提高采收物的品质;以及防治在农业、园艺业、畜牧业、水产业、林业、园林和休闲设施、储存产品和材料的保护以及在卫生领域中遇到的动物害虫,尤其是昆虫、蛛形纲动物、蠕虫、线虫和软体动物。它们可优选用作农药。它们对通常敏感的且具有抗性的物种是有效的,并且还对发育的所有阶段或特定阶段是有效的。上述害虫包括:

[0803] 节肢动物门(Arthropoda),尤其是蛛形纲(Arachnida)的害虫,例如粉螨属种(*Acarus* spp.),例如粗脚粉螨(*Acarus siro*);枸杞瘤瘿螨(*Aceria kuko*);柑橘瘤瘿螨(*Aceria sheldoni*);刺皮瘿螨属种(*Aculops* spp.);刺瘿螨属种(*Aculus* spp.),例如佛氏刺瘿螨(*Aculus fockeui*);苹果刺瘿螨(*Aculus schlechtendali*);花蜱属种(*Amblyomma* spp.);山楂叶螨(*Amphitetranychus viennensis*);锐缘蜱属种(*Argas* spp.);牛蜱属种(*Boophilus* spp.);短须螨属种(*Brevipalpus* spp.),例如紫红短须螨(*Brevipalpus phoenicis*);*Bryobia graminum*;苜蓿苔螨(*Bryobia praetiosa*);刺尾蝎属种(*Centruroides* spp.);皮螨属种(*Choriotptes* spp.);鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*);屋尘螨(*Dermatophagoides pteronyssius*);粉尘螨(*Dermatophagoides farinae*);革蜱属种(*Dermacentor* spp.);始叶螨属种(*Eotetranychus* spp.)如核桃始叶螨(*Eotetranychus hicoriae*);梨上瘿螨(*Epitrimerus pyri*);真叶螨属种(*Eutetranychus* spp.)如贝式真叶螨(*Eutetranychus banksi*);瘿螨属种(*Eriophyes* spp.)如梨瘿螨(*Eriophyes pyri*);家食甜螨(*Glycyphagus domesticus*);红足土螨(*Halotydeus destructor*);半跗线螨属种(*Hemitarsonemus* spp.)如茶半跗线螨(*Hemitarsonemus latus*)(=侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonemus latus*));璃眼蜱属种(*Hyalomma* spp.);硬蜱属种(*Ixodes* spp.);黑寡妇蜘蛛属种(*Latrodectus* spp.);斜蛛属种(*Loxosceles* spp.);秋收恙螨(*Neutrombicula autumnalis*);*Nuphersa*属种;小爪螨属种(*Oligonychus* spp.)如咖啡小爪螨(*Oligonychus coffeae*);松柏小爪螨(*Oligonychus coniferarum*);冬青小爪螨(*Oligonychus ilicis*);斑头鹰小爪螨(*Oligonychus indicus*);芒果小爪螨(*Oligonychus mangiferus*);草地小爪螨(*Oligonychus pratensis*);石榴小爪螨(*Oligonychus punicae*);樟小爪螨(*Oligonychus yothersi*);钝缘蜱属种(*Ornithodoros* spp.);禽刺螨

属种 (*Ornithonyssus* spp.); 全爪螨属种 (*Panonychus* spp.) 如桔全爪螨 (*Panonychus citri*) (= *Metatetranychus citri*)、苹果全爪螨 (*Panonychus ulmi*) (= *Metatetranychus ulmi*); 桔芸锈螨 (*Phyllocoptruta oleivora*); *Platytetranychus multidigituli*; 侧多食跗线螨 (*Polyphagotarsonemus latus*); 痒螨属种 (*Psoroptes* spp.); 扇头蜱属种 (*Rhipicephalus* spp.); 根螨属种 (*Rhizoglyphus* spp.); 疥螨属种 (*Sarcoptes* spp.); 中东金蝎 (*Scorpio maurus*); 狭跗线螨属种 (*Steneotarsonemus* spp.); 稻细螨 (*Steneotarsonemus spinki*); 跗线螨属种 (*Tarsonemus* spp.) 如乱跗线螨 (*Tarsonemus confusus*)、白跗线螨 (*Tarsonemus pallidus*); 叶螨属种 (*Tetranychus* spp.) 如黄花叶螨 (*Tetranychus canadensis*)、红叶螨 (*Tetranychus cinnabarinus*)、土耳其斯坦叶螨 (*Tetranychus turkestanii*)、二斑叶螨 (*Tetranychus urticae*); 恙螨 (*Trombicula alfreddugesi*)、*Vaejovis* 属种; 番茄刺皮瘿螨 (*Vasates lycopersici*);

[0804] 唇足纲 (*Chilopoda*) 的害虫, 例如地蜈蚣属种 (*Geophilus* spp.)、蚰蜒属种 (*Scutigera* spp.);

[0805] 弹尾目或弹尾纲 (*Collembola*) 的害虫, 例如武装棘跳虫 (*Onychiurus armatus*)、绿圆跳虫 (*Sminthurus viridis*);

[0806] 倍足纲 (*Diplopoda*) 的害虫, 例如 *Blaniulus guttulatus*;

[0807] 昆虫纲 (*Insecta*) 的害虫, 例如, 蜚蠊目 (*Blattodea*) 的害虫, 例如东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*)、亚洲蟑螂 (*Blattella asahinai*)、德国蟑螂 (*Blattella germanica*)、马德拉蜚蠊 (*Leucophaea maderae*)、*Loboptera decipiens*、家屋蟑螂 (*Neostylopyga rhombifolia*)、角腹蠊属种 (*Panchlora* spp.)、木蠊属种 (*Parcoblatta* spp.)、大蠊属种 (*Periplaneta* spp.) 如美洲大蠊 (*Periplaneta americana*)、澳洲大蠊 (*Periplaneta australasiae*)、潜伏蟑螂 (*Pycnoscelus surinamensis*)、褐带皮蠊 (*Supella longipalpa*);

[0808] 鞘翅目 (*Coleoptera*) 的害虫, 例如条纹南瓜甲虫 (*Acalymma vittatum*); 菜豆象 (*Acanthoscelides obtectus*); 喙丽金龟属种 (*Adoretus* spp.); 小蜂窝甲虫 (*Aethina tumida*); 杨树萤叶甲 (*Agelastica alni*); 叩甲属种 (*Agriotes* spp.) 如直条叩头虫 (*Agriotes linneatus*)、蒙叩甲 (*Agriotes mancus*); 黑菌甲 (*Alphitobius diaperinus*); 马铃薯鳃角金龟 (*Amphimallon solstitialis*); 具窃蠹 (*Anobium punctatum*); 星天牛属种 (*Anoplophora* spp.); 花象属种 (*Anthonomus* spp.) 如棉子象鼻虫 (*Anthonomus grandis*); 圆皮蠹属种 (*Anthrenus* spp.); 梨象属种 (*Apion* spp.); 阿鳃金龟属种 (*Apogonia* spp.); 隐食甲属种 (*Atomaria* spp.), 例如甜菜隐食甲 (*Atomaria linearis*); 毛皮蠹属种 (*Attagenus* spp.); *Baris caerulescens*; 恶条豆象 (*Bruchidius obtectus*); 豆象属种 (*Bruchus* spp.), 例如豌豆象 (*Bruchus pisorum*)、蚕豆象 (*Bruchus rufimanus*); 龟甲属种 (*Cassida* spp.); 菜豆萤叶甲 (*Cerotoma trifurcata*); 龟象属种 (*Ceutorrhynchus* spp.), 例如白菜杆龟象 (*Ceutorrhynchus assimilis*)、甘蓝茎象甲 (*Ceutorrhynchus quadridens*)、*Ceutorrhynchus rapae*; 凹胫跳甲属种 (*Chaetocnema* spp.), 例如甘薯叶甲 (*Chaetocnema confinis*)、*Chaetocnema denticulata*、粟凹胫跳甲 (*Chaetocnema ectypa*); *Cleonus mendicus*; 宽胸叩头虫属种 (*Conoderus* spp.); 根颈象属种 (*Cosmopolites* spp.), 例如香蕉象甲 (*Cosmopolites sordidus*); 褐新西兰肋翅鳃金龟

(*Costelytra zealandica*);叩甲属种(*Ctenicera* spp.);象虫属种(*Curculio* spp.),例如美核桃象(*Curculio caryae*)、*Curculio caryatrypes*、*Curculio obtusus*、*Curculio sayi*;锈赤扁谷盗(*Cryptolestes ferrugineus*);长角扁谷盗(*Cryptolestes pusillus*);杨干隐喙象(*Cryptorhynchus lapathi*);*Cryptorhynchus mangiferae*;细枝象属种(*Cylindrocopturus* spp.)、密点细枝象(*Cylindrocopturus adspersus*)、*Cylindrocopturus furnissi*;皮蠹属种(*Dermestes* spp.);叶甲属种(*Diabrotica* spp.),例如黄瓜条叶甲(*Diabrotica balteata*)、*Diabrotica barberi*、十一星瓜叶甲(*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*、玉米根萤叶甲(*Diabrotica virgifera virgifera*)、玉米根虫(*Diabrotica virgifera zea*);蛀野螟属种(*Dichocrocis* spp.);水稻铁甲(*Dicladispa armigera*);*Diloboderus*属种;食植瓢虫属种(*Epilachna* spp.),例如*Epilachna borealis*、墨西哥豆瓢虫(*Epilachna varivestis*);毛跳甲属种(*Epitrix* spp.),例如黄瓜跳甲(*Epitrix cucumeris*)、*Epitrix fuscula*、烟草跳甲(*Epitrix hirtipennis*)、美国马铃薯跳甲(*Epitrix subcrinita*)、块茎跳甲(*Epitrix tuberis*);*Faustinus*属种;裸蛛甲(*Gibbium psyllodes*);阔角谷盗(*Gnathocerus cornutus*);菜心野螟(*Hellula undalis*);黑异爪鹿金龟(*Heteronychus arator*);寡节舍思金龟属种(*Heteronyx* spp.);*Hylamorpha elegans*;家希天牛(*Hylotrupes bajulus*);紫苜蓿叶象(*Hypera postica*);金象甲(*Hypomeces squamosus*);果小蠹属种(*Hypothenemus* spp.),例如咖啡果小蠹(*Hypothenemus hampei*)、*Hypothenemus obscurus*、*Hypothenemus pubescens*;甘蔗大褐齿爪鳃金龟(*Lachnosterna consanguinea*);锯角毛食骸甲(*Lasioderma serricorne*);长首谷盗(*Latheticus oryzae*);薪甲属种(*Lathridius* spp.);合爪负泥虫属种(*Lema* spp.);马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata*);潜蛾属种(*Leucoptera* spp.),例如咖啡潜叶蛾(*Leucoptera coffeella*);稻根象(*Lissorhoptrus oryzophilus*);卜象属种(*Listronotus* spp.) (= *Hyperodes* spp.);筒味象属种(*Lixus* spp.);*Luperomorpha xanthodera*; *Luperodes*属种;粉蠹属种(*Lyctus* spp.);美洲叶甲属种(*Megascelis* spp.);梳爪叩头虫属种(*Melanotus* spp.),例如*Melanotus longulus oregonensis*;油菜露尾甲(*Meligethes aeneus*);鳃金龟属种(*Melolontha* spp.),例如大栗鳃角金龟(*Melolontha melolontha*);*Migdolus*属种;墨天牛属种(*Monochamus* spp.);葡萄短须螨(*Naupactus xanthographus*);隐跗郭公虫属种(*Necrobia* spp.);*Neogalerucella*属种;黄蛛甲(*Niptus hololeucus*);椰姓犀金龟(*Oryctes rhinoceros*);锯谷盗(*Oryzaephilus surinamensis*);*Oryzaphagus oryzae*;耳象属种(*Otiorhynchus* spp.),例如*Otiorhynchus cribricollis*、*Otiorhynchus ligustici*、*Otiorhynchus ovatus*、*Otiorhynchus rugosostriatus*、*Otiorhynchus sulcatus*;束颈金花虫属种(*Oulema* spp.),例如负泥虫(*Oulema melanopus*)、水稻负泥虫(*Oulema oryzae*);小青花金龟(*Oxycetonia jucunda*);辣根猿叶甲(*Phaedon cochleariae*);食叶觸金龟属种(*Phyllophaga* spp.)、*Phyllophaga helleri*;菜跳甲属种(*Phyllotreta* spp.),例如*Phyllotreta armoraciae*、*Phyllotreta pusilla*、*Phyllotreta ramosa*、黄曲条跳甲(*Phyllotreta striolata*);日本丽金龟(*Popillia japonica*);象甲属种(*Premnotrypes* spp.);大谷蠹(*Prostephanus truncatus*);跳甲属种(*Psylliodes* spp.),例如*Psylliodes affinis*、油菜金头跳甲(*Psylliodes*

chrysocephala)、忽布跳甲 (*Psylliodes punctulata*); 蛛甲属种 (*Ptinus* spp.); 暗色瓢虫 (*Rhizobius ventralis*); 谷蠹 (*Rhizopertha dominica*); 隐颈象属种 (*Rhynchophorus* spp.); 红棕象甲 (*Rhynchophorus ferrugineus*); 棕榈象甲 (*Rhynchophorus palmarum*); *Sinoxylon perforans*; 谷象属种 (*Sitophilus* spp.), 例如谷象 (*Sitophilus granarius*)、*Sitophilus linearis*、米象 (*Sitophilus oryzae*)、玉米象 (*Sitophilus zeamais*); 尖隐喙象属种 (*Sphenophorus* spp.); 小圆皮蠹 (*Stegobium paniceum*); 茎干象属种 (*Sternechus* spp.), 例如 *Sternechus paludatus*; *Symphyletes* 属种; 纤毛象属种 (*Tanymecus* spp.), 例如 *Tanymecus dilaticollis*、*Tanymecus indicus*、*Tanymecus palliatus*; 黄粉甲 (*Tenebrio molitor*); 大谷盗 (*Tenebrioides mauretanicus*); 拟谷盗属种 (*Tribolium* spp.), 例如 *Tribolium audax*、赤拟谷盗 (*Tribolium castaneum*)、杂拟谷盗 (*Tribolium confusum*); 斑皮蠹属种 (*Trogoderma* spp.); 籽象属种 (*Tychius* spp.); 脊虎天牛属种 (*Xylotrechus* spp.); 距步甲属种 (*Zabrus* spp.), 例如玉米距步甲 (*Zabrus tenebrioides*);

[0809] 革翅目 (Dermaptera) 的害虫, 例如 *Anisolabis maritime*、欧洲球蠊 (*Forficula auricularia*)、溪岸蠊 (*Labidura riparia*);

[0810] 双翅目 (Diptera) 的害虫, 例如, 伊蚊属种 (*Aedes* spp.), 例如埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*)、白纹伊蚊 (*Aedes albopictus*)、叮刺伊蚊 (*Aedes sticticus*)、刺扰伊蚊 (*Aedes vexans*); 潜蝇属种 (*Agromyza* spp.), 例如苜蓿斑潜蝇 (*Agromyza frontella*)、美洲黍潜蝇 (*Agromyza parvicornis*); 实蝇属种 (*Anastrepha* spp.); 按蚊属种 (*Anopheles* spp.), 例如四斑按蚊 (*Anopheles quadrimaculatus*)、冈比亚按蚊 (*Anopheles gambiae*); 瘦蚊属种 (*Asphondylia* spp.); 果实蝇属种 (*Bactrocera* spp.), 例如瓜实蝇 (*Bactrocera cucurbitae*)、东方果实蝇 (*Bactrocera dorsalis*)、油橄榄果实蝇 (*Bactrocera oleae*); 花园毛蚊 (*Bibio hortulanus*); 红头丽蝇 (*Calliphora erythrocephala*)、天青丽蝇 (*Calliphora vicina*); 地中海实蝇 (*Ceratitis capitata*); 摇蚊属种 (*Chironomus* spp.); 金蝇属种 (*Chrysomya* spp.); 斑虻属种 (*Chrysops* spp.); 高额麻虻 (*Chrysozona pluvialis*); 锥蝇属种 (*Cochliomya* spp.); 康瘿蚊属种 (*Contarinia* spp.), 例如葡萄瘿蚊 (*Contarinia johnsoni*)、甘蓝瘿蚊 (*Contarinia nasturtii*)、梨叶瘿蚊 (*Contarinia pyrivora*)、向日葵瘿蚊 (*Contarinia schulzi*)、高粱瘿蚊 (*Contarinia sorghicola*)、麦黄吸浆虫 (*Contarinia tritici*); 人皮蝇 (*Cordylobia anthropophaga*); 树真环足摇蚊 (*Cricotopus sylvestris*); 库蚊属种 (*Culex* spp.), 例如尖音库蚊 (*Culex pipiens*)、致倦库蚊 (*Culex quinquefasciatus*); 库蠓属种 (*Culicoides* spp.); 脉毛蚊属种 (*Culiseta* spp.); 黄蝇属种 (*Cuterebra* spp.); 油橄榄实蝇 (*Dacus oleae*); 叶瘿蚊属种 (*Dasineura* spp.), 例如油菜莢叶瘿蚊 (*Dasineura brassicae*); 地种蝇属种 (*Delia* spp.), 例如葱地种蝇 (*Delia antiqua*)、麦地种蝇 (*Delia coarctata*)、毛跗地种蝇 (*Delia florilega*)、灰地种蝇 (*Delia platura*)、甘蓝地种蝇 (*Delia radicum*); 人肤蝇 (*Dermatobia hominis*); 果蝇属种 (*Drosophila* spp.), 例如黄猩猩果蝇 (*Drosophila melanogaster*)、樱桃果蝇 (*Drosophila suzukii*); 稻象属种 (*Echinocnemus* spp.); *Euleia heraclei*; 厕蝇属种 (*Fannia* spp.); 胃蝇属种 (*Gasterophilus* spp.); 舌蝇属种 (*Glossina* spp.); 麻蛇属种 (*Haematopota* spp.); 毛眼水蝇属种 (*Hydrellia* spp.); 大麦水蝇 (*Hydrellia griseola*);

黑蝇属种 (*Hylemya* spp.); 虱蝇属种 (*Hippobosca* spp.); 皮蝇属种 (*Hypoderma* spp.); 斑潜蝇属种 (*Liriomyza* spp.), 例如菜斑潜蝇 (*Liriomyza brassicae*)、南美斑潜蝇 (*Liriomyza huidobrensis*)、美洲斑潜蝇 (*Liriomyza sativae*); 绿蝇属种 (*Lucilia* spp.), 例如铜绿蝇 (*Lucilia cuprina*); 罗岭属种 (*Lutzomyia* spp.); 曼蚊属种 (*Mansonia* spp.); 家蝇属种 (*Musca* spp.), 例如家蝇 (*Musca domestica*)、舍蝇 (*Musca domestica vicina*); 狂蝇属种 (*Oestrus* spp.); 瑞典麦秆蝇 (*Oscinella frit*); 摇蚊属种 (*Paratanytarsus* spp.); *Paralauterborniella subcincta*; 泉蝇属种 (*Pegomya* spp.), 例如甜菜蝇 (*Pegomya betae*)、甜菜潜叶蝇 (*Pegomya hyoscyami*)、悬钩子泉蝇 (*Pegomya rubivora*); 白蛉属种 (*Phlebotomus* spp.); 草种蝇属种 (*Phorbia* spp.); 伏蝇属种 (*Phormia* spp.); 酪蝇 (*Piophilidae casei*); *Platyparea poeciloptera*; *Prodiplosis* 属种; 胡萝卜茎蝇 (*Psila rosae*); 绕实蝇属种 (*Rhagoletis* spp.), 例如樱桃实蝇 (*Rhagoletis cingulata*)、胡桃绕实蝇 (*Rhagoletis completa*)、黑樱桃实蝇 (*Rhagoletis fausta*)、西部樱桃实蝇 (*Rhagoletis indifferens*)、越桔实蝇 (*Rhagoletis mendax*)、苹果实蝇 (*Rhagoletis pomonella*); 麻蝇属种 (*Sarcophaga* spp.); 蚋亚属种 (*Simulium* spp.), 例如南方蚋 (*Simulium meridionale*); 螫蝇属种 (*Stomoxys* spp.); 虻属种 (*Tabanus* spp.); 根斑蝇属种 (*Tetanops* spp.); 大蚊属种 (*Tipula* spp.), 例如欧洲大蚊 (*Tipula paludosa*)、牧场大蚊 (*Tipula simplex*); 木瓜馱实蝇 (*Toxotrypana curvicauda*);

[0811] 半翅目 (Hemiptera) 的害虫, 例如, *Acizzia acaciaebaileyanae*、*Acizzia dodonaeae*、*Acizzia uncatoides*; 头尖蝗 (*Acrida turrita*); 无网长管蚜属种 (*Acyrtosiphon* spp.), 例如豌豆长管蚜 (*Acyrtosiphon pisum*); *Acrogonia* 属种; 沫蝉属种 (*Aeneolamia* spp.); 隆脉木虱属种 (*Agonosceles* spp.); 欧洲甘蓝粉虱 (*Aleyrodes proletella*); 甘蔗穴粉虱 (*Aleurolobus barodensis*); 软毛粉虱 (*Aleurothrixus floccosus*); 植莲木虱 (*Allocaridara malayensis*); 芒果叶蝶属种 (*Amrasca* spp.), 例如小叶绿蝶 (*Amrasca bigutulla*)、*Amrasca devastans*; 飞廉短尾蚜 (*Anuraphis cardui*); 肾圆盾蚧属种 (*Aonidiella* spp.), 例如红肾圆盾蚧 (*Aonidiella aurantii*)、黄圆蹄盾蚧 (*Aonidiella citrina*)、木瓜赤圆介壳虫 (*Aonidiella inornata*); 梨瘤蚜 (*Aphanostigma piri*); 蚜属种 (*Aphis* spp.), 例如绣线菊蚜 (*Aphis citricola*)、甘草蚜虫 (*Aphis craccivora*)、甜菜蚜 (*Aphis fabae*)、草莓根蚜 (*Aphis forbesi*)、大豆蚜 (*Aphis glycines*)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)、常春藤蚜 (*Aphis hederarum*)、*Aphis illinoisensis*、*Aphis middletoni*、鼠李马铃薯蚜 (*Aphis nasturtii*)、竹桃蚜 (*Aphis nerii*)、苹果蚜 (*Aphis pomi*)、绣线菊蚜 (*Aphis spiraeicola*)、*Aphis viburniphila*; 葡萄叶蜂 (*Arboridia apicalis*); *Arytainilla* 属种; 小圆盾蚧属种 (*Aspidiella* spp.); 薄圆盾蚧属种 (*Aspidiotus* spp.), 例如春藤圆蚧 (*Aspidiotus nerii*); 圆盾蚧属种 (*Atanus* spp.); 茄沟无网蚜 (*Aulacorthum solani*); 烟粉虱 (*Bemisia tabaci*); 澳大利亚木虱 (*Blastopsylla occidentalis*); *Boreioglycaspis melaleuca*; 李短尾蚜 (*Brachycaudus helichrysi*); 微管蚜属种 (*Brachycolus* spp.); 甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*); 喀木虱属种 (*Cacopsylla* spp.), 例如梨木虱 (*Cacopsylla pyricola*); 小褐稻虱 (*Calligypona marginata*); *Capulinia* 属种; 红头大叶蝉 (*Carneocephala fulgida*); 甘鹿粉角蚜 (*Ceratovacuna lanigera*); 沫蝉科 (*Cercopidae*); 蜡蚧属种 (*Ceroplastes* spp.); 草莓钉

蚜(*Chaetosiphon fragaefolii*); 蒿雪盾蚧(*Chionaspis tegalensis*); 茶绿叶蜂(*Chlorita onukii*); 台湾大蝗(*Chondracris rosea*); 核桃黑斑蚜(*Chromaphis juglandicola*); 黑褐圆盾蚧(*Chrysomphalus aonidum*); 褐圆介壳虫(*Chrysomphalus ficus*); 玉米叶蜂(*Cicadulina mbila*); *Coccoxylus halli*; 软蚧属种(*Coccus* spp.), 例如褐软蚧(*Coccus hesperidum*)、长椭圆软蚧(*Coccus longulus*)、橘软蜡蚧(*Coccus pseudomagnoliarum*)、咖啡绿软蚧(*Coccus viridis*); 隐瘤蚜(*Cryptomyzus ribis*); *Cryptoneossa*属种; 梳木虱属种(*Ctenarytaina* spp.); *Dalbulus*属种; 柑橘粉虱(*Dialeurodes citri*); 柑橘木虱(*Diaphorina citri*); 白背盾蚧属种(*Diaspis* spp.); 双尾蚜属种(*Diuraphis* spp.); *Doralis*属种; 履绵蚧属种(*Drosicha* spp.); 西圆尾蚜属种(*Dysaphis* spp.), 例如锈条蚜(*Dysaphis apiifolia*)、车前圆尾蚜(*Dysaphis plantaginea*)、圆尾蚜(*Dysaphis tulipae*); 灰粉蚧属种(*Dysmicoccus* spp.); 小绿叶蝉属种(*Empoasca* spp.), 例如西部马铃薯微叶蝉(*Empoasca abrupta*)、马铃薯小绿叶蝉(*Empoasca fabae*)、苹果小绿叶蝉(*Empoasca maligna*)、*Empoasca solana*、*Empoasca stevensi*; 绵蚜属种(*Eriosoma* spp.), 例如*Eriosoma americanum*、苹果绵蚜(*Eriosoma lanigerum*)、居梨绵蚜(*Eriosoma pyricola*); 斑叶蝉属种(*Erythroneura* spp.); *Eucalyptolyma*属种; 褐木虱属种(*Euphyllura* spp.); *Euscelis bilobatus*; 弗氏粉蚧科(*Ferrisia* spp.); 围盾介壳虫属种(*Fiorinia* spp.); 大洋洲围盾介壳虫(*Furcaspis oceanica*); 咖啡地粉蚧(*Geococcus coffeae*); *Glycaspis*属种; 银合欢木虱(*Heteropsylla cubana*); 颊木虱(*Heteropsylla spinulosa*); 假桃病毒叶蜂(*Homalodisca coagulata*); 桃大尾蚜(*Hyalopterus arundinis*)、桃粉蚜(*Hyalopterus pruni*); 吹绵蚧属种(*Icerya* spp.), 例如吹绵蚧(*Icerya purchasi*); 片角叶蜂属种(*Idiocerus* spp.); 扁喙叶蝉属种(*Idioscopus* spp.); 灰飞虱(*Laodelphax striatellus*); 蜡蚧属种(*Lecanium* spp.), 例如李蜡蚧(*Lecanium corni*) (= *Parthenolecanium corni*); 牡蛎蚧属种(*Lepidosaphes* spp.), 例如榆蛎盾蚧(*Lepidosaphes ulmi*); 菜缢管蚜(*Lipaphis erysimi*); 日本长白蚧(*Lopholeucaspis japonica*); 斑衣蜡蝉(*Lycorma delicatula*); 长管蚜属种(*Macrosiphum* spp.), 例如马铃薯长管蚜(*Macrosiphum euphorbiae*)、*Macrosiphum lillii*、蔷薇长管蚜(*Macrosiphum rosae*); 二点叶蜂(*Macrosteles facifrons*); 沫蝶属种(*Mahanarva* spp.); 高粱蚜(*Melanaphis sacchari*); *Metcalfiella*属种; *Metcalfa pruinosa*; 麦无网长管蚜(*Metopolophium dirhodum*); 黑缘平翅斑蚜(*Monellia costalis*); *Monelliopsis pecanis*; 瘤蚜属种(*Myzus* spp.), 例如冬葱蚜(*Myzus ascalonicus*)、黑樱桃蚜(*Myzus cerasi*)、*Myzus ligustri*、瘤额蚜(*Myzus ornatus*)、桃蚜(*Myzus persicae*)、烟蚜(*Myzus nicotianae*); 苎蓎长管蚜(*Nasonovia ribisnigri*); 新马粉虱属种(*Neomaskellia* spp.); 黑尾叶蝉属种(*Nephotettix* spp.), 例如黑尾叶蝉(*Nephotettix cincticeps*)、二条斑黑尾叶蝉(*Nephotettix nigropictus*); *Nettigoniclla spectra*; 褐飞虱(*Nilaparvata lugens*); *Oncometopia*属种; *Orthezia praelonga*; 中华稻蝗(*Oxya chinensis*); *Pachypsylla*属种; 杨梅缘粉虱(*Parabemisia myricae*); 薯个木虱属种(*Paratrioza* spp.), 例如马铃薯木虱(*Paratrioza cockerelli*); 片盾蚧属种(*Parlatoria* spp.); 瘦绵蚜属种(*Pemphigus* spp.), 例如囊柄瘿绵蚜(*Pemphigus bursarius*)、*Pemphigus populivenae*; 玉米蜡蝉(*Peregrinus maidis*); 扁角飞虱属种(*Perkinsiella* spp.); 绵粉

蚧属种 (*Phenacoccus* spp.), 例如苏铁褐点并盾蚧 (*Phenacoccus madeirensis*); *Phloeomyzus passerinii*; 忽布疣额蚜 (*Phorodon humuli*); 葡萄根瘤蚜 (*Phylloxera* spp.), 例如 *Phylloxera devastatrix*、警根瘤蚜 (*Phylloxera notabilis*); 苏铁褐点并盾蚧 (*Pinnaspis aspidistrae*); 臀纹粉蚧属种 (*Planococcus* spp.), 例如臀纹粉蚧 (*Planococcus citri*); *Prosopidopsylla flava*; 梨形原绵蚧 (*Protopulvinaria pyriformis*); 桑白盾蚧 (*Pseudaulacaspis pentagona*); 粉蚧属种 (*Pseudococcus* spp.), 例如嗜桔粉蚧 (*Pseudococcus calceolariae*)、康氏粉蚧 (*Pseudococcus comstocki*)、长尾粉蚧 (*Pseudococcus longispinus*)、真葡萄粉蚧 (*Pseudococcus maritimus*)、暗色粉蚧 (*Pseudococcus viburni*); *Psyllopsis* 属种; 木虱属种 (*Psylla* spp.), 例如 *Psylla buxi*、苹木虱 (*Psylla mali*)、梨木虱 (*Psylla pyri*); 金小蜂属种 (*Pteromalus* spp.); 绵蜡蚧属种 (*Pulvinaria* spp.); *Pyrilla* 属种; 齿盾蚧属种 (*Quadraspidotus* spp.), 例如胡桃圆盾蚧 (*Quadraspidotus juglansregiae*)、杨笠圆盾蚧 (*Quadraspidotus ostreaeformis*)、梨圆盾蚧 (*Quadraspidotus perniciosus*)、*Quesada gigas*; 平刺粉蚧属种 (*Rastrococcus* spp.); 缢管蚜属种 (*Rhopalosiphum* spp.), 例如玉米缢管蚜 (*Rhopalosiphum maidis*)、*Rhopalosiphum oxyacanthae*、稻麦蚜 (*Rhopalosiphum padi*)、*Rhopalosiphum rufiabdominale*; 黑盔蚧属种 (*Saissetia* spp.), 例如咖啡蜡蚧 (*Saissetia coffeae*)、*Saissetia miranda*、*Saissetia neglecta*、黑蜡蚧 (*Saissetia oleae*); 葡萄带叶蝉 (*Scaphoideus titanus*); 麦二叉蚜 (*Schizaphis graminum*); 刺盾蚧 (*Selenaspidus articulatus*); *Sipha flava*; 麦长管蚜 (*Sitobion avenae*); 长唇基飞虱属种 (*Sogata* spp.); 白背飞虱 (*Sogatella furcifera*); *Sogatodes* 属种; 三角蜂 (*Stictocephala festina*); 树粉虱 (*Siphoninus phillyreae*); *Tenalaphara malayensis*; *Tetragonocephala* 属种; 美国核桃黑蚜 (*Tinocallis caryaefoliae*); 广胸沫蝉属种 (*Tomaspis* spp.); 声蚜属种 (*Toxoptera* spp.), 例如桔二叉蚜 (*Toxoptera aurantii*)、桔蚜 (*Toxoptera citricidus*); 温室粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*); 尖翅木虱属种 (*Trioza* spp.), 例如 *Trioza diospyri*; 小叶蝉属种 (*Typhlocyba* spp.); 矢尖盾蚧属种 (*Unaspis* spp.); 葡萄根瘤蚜 (*Viteus vitifolii*); 么叶蝉属种 (*Zygina* spp.);

[0812] 异翅亚目 (*Heteroptera*) 的害虫, 例如, 麦蝽属种 (*Aelia* spp.); 南瓜缘蝽 (*Anasa tristis*); 拟丽蝽属种 (*Antestiopsis* spp.); *Boisea* 属种; 土长蝽属种 (*Blissus* spp.); 俊盲蝽属种 (*Calocoris* spp.); 斑腿微刺盲蝽 (*Campylomma livida*); 异背长蝽属种 (*Cavelerius* spp.); 臭虫属种 (*Cimex* spp.), 例如 *Cimex adjunctus*、热带臭虫 (*Cimex hemipterus*)、温带臭虫 (*Cimex lectularius*)、蝠臭虫 (*Cimex pilosellus*); 白瓣麦寄蝇属种 (*Collaria* spp.); 绿盲蝽 (*Creontiades dilutus*); 胡椒缘蝽 (*Dasynus piperis*); *Dichelops furcatus*; 厚氏长棒网蝽 (*Diconocoris hewetti*); 棉红蝽属种 (*Dysdercus* spp.); 美洲蝽属种 (*Euschistus* spp.), 例如 *Euschistus heros*、褐臭蝽 (*Euschistus servus*)、*Euschistus tristigmus*、斑点美洲蝽 (*Euschistus variolarius*); 扁盾蝽属种 (*Eurygaster* spp.); 茶翅蝽 (*Halyomorpha halys*); *Heliopeltis* 属种; *Horcias nobilellus*; 稻缘蝽属种 (*Leptocorisa* spp.); 稻缘椿象 (*Leptocorisa varicornis*); *Leptoglossus occidentalis*; 叶足缘蝽 (*Leptoglossus phyllopus*); 丽盲蝽属种 (*Lygocoris* spp.), 例如原丽盲蝽 (*Lygocoris pabulinus*); 草盲蝽属种 (*Lygus* spp.), 例

如Lygus elisus、豆莢草盲蝽(Lygus hesperus)、牧草盲蝽(Lygus lineolaris);盲黑长蝽(Macropes excavatus);筛豆龟蝽(Megacopta cribraria);盲蝽科(Miridae);黑摩盲蝽(Monalonion atratum);稻绿蝽属种(Nezara spp.),例如稻绿蝽(Nezara viridula);小长蝽属种(Nysius spp.);稻蝽属种(Oebalus spp.);Pentomidae;甜菜拟网蝽(Piesma quadrata)、壁蝽属种(Piezodorus spp.),例如盖德拟壁蝽(Piezodorus guildinii);盲蝽属种(Psallus spp.);Pseudacysta perseae;红猎蝽属种(Rhodnius spp.);可可褐盲蝽(Sahlbergella singularis);Scaptocoris castanea;黑蝽属种(Scotinophora spp.);梨冠网蝽(Stephanitis nashi);Tibraca属种;骚扰锥蝽(Triatoma spp.);

[0813] 膜翅目(Hymenoptera)的害虫,例如顶切叶蚁属种(Acromyrmex spp.);菜叶蜂属种(Athalia spp.);例如黄翅菜叶蜂(Athalia rosae);切叶蚁属种(Atta spp.);弓背蚁属种(Camponotus spp.);黄蜂属种(Dolichovespula spp.);松叶蜂属种(Diprion spp.),例如类欧松叶蜂(Diprion similis);实叶蜂属种(Hoplocampa spp.),例如樱实叶蜂(Hoplocampa cookei)、苹叶蜂(Hoplocampa testudinea);毛蚁属种(Lasius spp.);阿根廷蚁(Linepithema(Iridomyrmex) humile);法老蚁(Monomorium pharaonis);立毛蚁属种(Paratrechina spp.);Paravespula属种;斜结蚁属种(Plagiolepis spp.);树蜂属种(Sirex spp.);红火蚁(Solenopsis invicta);蚁属种(Tapinoma spp.);Technomyrmex albipes;大树蜂属种(Urocerus spp.);胡蜂属种(Vespa spp.),例如黄边胡蜂(Vespa crabro);小火蚁(Wasmannia auropunctata);黑树蜂属种(Xeris spp.);

[0814] 等足目(Isopoda)的害虫,例如鼠妇(Armadillidium vulgare)、栉水虱(Oniscus asellus)、球鼠妇(Porcellio scaber);

[0815] 等翅目(Isoptera)的害虫,例如乳白蚁属种(Coptotermes spp.),例如台湾乳白蚁(Coptotermes formosanus);堆角白蚁(Cornitermes cumulans);砂白蚁属种(Cryptotermes spp.);楹白蚁属种(Incisitermes spp.);木白蚁属种(Kaloterms spp.);稻麦小白蚁(Microtermes obesi);象白蚁属种(Nasutitermes spp.);土白蚁属种(Odontotermes spp.);散白蚁属种(Reticulitermes spp.),例如北美散白蚁(Reticulitermes flavipes)、西方犀白蚁(Reticulitermes hesperus);

[0816] 鳞翅目(Lepidoptera)的害虫,例如小蜡螟(Achroia grisella);桑剑纹夜蛾(Acrionicta major);褐带卷蛾属种(Adoxophyes spp.),例如棉褐带卷蛾(Adoxophyes orana);烦夜蛾(Aedia leucomelas);地夜蛾属种(Agrotis spp.),例如菩夜蛾(Agrotis segetum)、球菜夜蛾(Agrotis ipsilon);波纹夜蛾属种(Alabama spp.),例如棉叶波纹夜蛾(Alabama argillacea);脐橙螟(Amyelois transitella);条麦蛾属种(Anarsia spp.);干煞夜蛾属种(Anticarsia spp.),例如梨豆夜蛾(Anticarsia gemmatalis);条小卷蛾属种(Argyroploce spp.);丫纹夜蛾属种(Autographa spp.);甘蓝夜蛾(Barathra brassicae);苹髓尖蛾(Blastodacna atra);粘弄蝶(Borbo cinnara);棉潜蛾(Bucculatrix thurberiella);松尺蠖(Bupalus piniarius);蛀褐夜蛾属种(Busseola spp.);卷蛾属种(Cacoecia spp.);茶细蛾(Caloptilia theivora);烟卷蛾(Capua reticulana);苹果蠹蛾(Carpocapsa pomonella);桃蛀果蛾(Carposina niponensis);冬尺蛾(Cheimatobia brumata)、禾草螟属种(Chilo spp.),例如禾草螟(Chilo plejadellus)、二化螟(Chilo suppressalis);Choreutis pariana;色卷蛾属种

(*Choristoneura* spp.); *Chrysodeixis chalcites*; 葡萄果蠹蛾 (*Clysia ambiguella*); 纵卷叶野螟属种 (*Cnaphalocerus* spp.); 稻纵卷叶螟 (*Cnaphalocrocis medinalis*); 云卷蛾属种 (*Cnephasia* spp.); 细蛾属种 (*Conopomorpha* spp.); 球颈象属种 (*Conotrachelus* spp.); *Copitarsia* 属种; 卷蛾属种 (*Cydia* spp.), 例如豌豆小卷蛾 (*Cydia nigricana*)、苹果果蠹蛾 (*Cydia pomonella*); *Dalaca noctuides*; 绢野螟属种 (*Diaphania* spp.); *Diparopsis* 属种; 小蔗杆草螟 (*Diatraea saccharalis*); 钻夜蛾属种 (*Earias* spp.); *Ecdytolopha aurantium*; 玉米茎蛀虫 (*Elasmopalpus lignosellus*); 甘薯杆螟 (*Eldana saccharina*); 粉斑螟属种 (*Ephestia* spp.), 例如烟草粉斑螟 (*Ephestia elutella*)、欧洲麦粉蛾 (*Ephestia kuehniella*); 叶小卷蛾属种 (*Epinotia* spp.); 苹果褐卷蛾 (*Epiphyas postvittana*); 松尺蛾属种 (*Erannis* spp.); *Erschoviella musculana*; 莢斑螟属种 (*Etiella* spp.); 夜蛾属种 (*Eudocima* spp.); 棕卷蛾属种 (*Eulia* spp.); 女贞细卷蛾 (*Eupoecilia ambiguella*); 黄毒蛾属种 (*Euproctis* spp.), 例如棕尾毒蛾 (*Euproctis chrysorrhoea*); 切夜蛾属种 (*Euxoa* spp.); 脏切叶蛾属种 (*Feltia* spp.); 大蜡螟 (*Galleria mellonella*); 细蛾属种 (*Gracillaria* spp.); 小食心虫属种 (*Grapholitha* spp.), 例如梨小食心虫 (*Grapholita molesta*)、杏小食心虫 (*Grapholita prunivora*); 蚀叶野螟属种 (*Hedylepta* spp.); 铃夜蛾属种 (*Helicoverpa* spp.), 例如棉铃虫 (*Helicoverpa armigera*)、谷实夜蛾 (*Helicoverpa zea*); 实夜蛾属种 (*Heliothis* spp.), 例如烟芽夜蛾 (*Heliothis virescens*); 褐家蛾 (*Hofmannophila pseudospretella*); 斑螟属种 (*Homoeosoma* spp.); 长卷蛾属种 (*Homona* spp.); 苹果巢蛾 (*Hyponomeuta padella*); 柿蒂虫 (*Kakivoria flavofasciata*); 亮灰蝶属种 (*Lampides* spp.); 夜蛾属种 (*Laphygma* spp.); *Laspeyresia molesta*; 黄斑螟 (*Leucinodes orbonalis*); 银潜蛾属种 (*Leucoptera* spp.), 例如咖啡潜叶蛾 (*Leucoptera coffeella*); 潜叶细蛾属种 (*Lithocolletis* spp.), 例如苹果斑幕潜叶蛾 (*Lithocolletis blancardella*); 绿果冬夜蛾 (*Lithophane antennata*); 花翅小蛾属种 (*Lobesia* spp.), 例如鲜食葡萄小卷蛾 (*Lobesia botrana*); 豆白隆切根虫 (*Loxagrotis albicosta*); 毒蛾属种 (*Lymantria* spp.), 例如舞毒蛾 (*Lymantria dispar*); 潜蛾属种 (*Lyonetia* spp.), 例如桃潜叶蛾 (*Lyonetia clerkella*); 天幕毛虫 (*Malacosoma neustria*); 豆莢野螟 (*Maruca testulalis*); 甘蓝夜蛾 (*Mamestra brassicae*); 暮眼蝶 (*Melanitis leda*); 毛胫夜蛾属种 (*Mocis* spp.); *Monopis obviella*; 粘虫 (*Mythimna separata*); 橡长角蛾 (*Nemapogon cloacellus*); 水螟属种 (*Nymphula* spp.); *Oiketicus* 属种; 竹蠹螟属种 (*Omphisa* spp.); 秋尺蛾属种 (*Operophtera* spp.); 麦秆夜蛾属种 (*Oria* spp.); 瘤丛螟属种 (*Orthaga* spp.); 秆野螟属种 (*Ostrinia* spp.), 例如玉米螟 (*Ostrinia nubilalis*); 小眼夜蛾 (*Panolis flammea*); 稻弄蝶属种 (*Parnara* spp.); 红铃麦蛾属种 (*Pectinophora* spp.), 例如棉红铃虫 (*Pectinophora gossypiella*); 潜跳甲属种 (*Perileucoptera* spp.); 烟尺蛾属种 (*Phthorimaea* spp.), 例如马铃薯块茎蛾 (*Phthorimaea operculella*); 柑桔潜叶蛾 (*Phyllocnistis citrella*); 小潜细蛾属种 (*Phyllonorycter* spp.), 例如斑幕潜叶蛾 (*Phyllonorycter blancardella*)、山楂潜叶蛾 (*Phyllonorycter crataegella*); 粉蝶属种 (*Pieris* spp.), 例如菜粉蝶 (*Pieris rapae*); 荷兰石竹小卷蛾 (*Platynota stultana*); 印度谷螟 (*Plodia interpunctella*); 金翅夜蛾属种 (*Plusia* spp.); 小菜蛾 (*Plutella xylostella* (= *Plutella maculipennis*)); 小白巢蛾

属种 (*Prays* spp.); 斜纹夜蛾属种 (*Prodenia* spp.); 烟草天鹅属种 (*Protoparce* spp.); 黏虫属种 (*Pseudaletia* spp.), 例如一星黏虫 (*Pseudaletia unipuncta*); 大豆尺夜蛾 (*Pseudoplusia includens*); 玉蜀黍螟 (*Pyrausta nubilalis*); 尺蠖 (*Rachiplusia nu*)、水稻稻褐边螟 (*Schoenobius* spp.), 例如 *Schoenobius bipunctifer*; 白禾螟属种 (*Scirpophaga* spp.), 例如钻蛀性害虫稻白螟 (*Scirpophaga innotata*); 黄地老虎 (*Scotia segetum*); 蛀茎夜蛾属种 (*Sesamia* spp.), 例如水稻大螟 (*Sesamia inferens*); 长须卷蛾属种 (*Sparganothis* spp.); 灰翅夜蛾属种 (*Spodoptera* spp.), 例如 *Spodoptera eradiana*、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua*)、草地贪夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*)、*Spodoptera praefica*; 展足蛾属种 (*Stathmopoda* spp.); 碱黄鹌菜属种 (*Stenoma* spp.); 花生卷叶麦蛾 (*Stomopteryx subsecivella*); 兴透翅蛾属种 (*Synanthedon* spp.); 安第斯马铃薯块茎蛾 (*Tecia solanivora*); 异舟蛾属种 (*Thaumetopoea* spp.); *Thermesia gemmatilis*; 木塞谷蛾 (*Tinea cloacella*); 袋谷蛾 (*Tinea pellionella*); 幕谷蛾 (*Tineola bisselliella*); 卷叶蛾 (*Tortrix* spp.); 毛毡衣蛾 (*Trichophaga tapetzella*); 粉夜蛾属种 (*Trichoplusia* spp.), 例如粉纹夜蛾 (*Trichoplusia ni*); 三化螟 (*Tryporyza incertulas*); 番茄斑潜蝇 (*Tuta absoluta*); 灰蝶属种 (*Virachola* spp.);

[0817] 直翅目 (*Orthoptera*) 或跳跃目 (*Saltatoria*) 的害虫, 例如家蟋蟀 (*Acheta domesticus*); *Dichroplus* 属种; 蝼蛄属种 (*Gryllotalpa* spp.), 例如欧洲蝼蛄 (*Gryllotalpa gryllotalpa*); 蔗蝗属种 (*Hieroglyphus* spp.); 飞蝗属种 (*Locusta* spp.), 例如东亚飞蝗 (*Locusta migratoria*); 黑蝗属种 (*Melanoplus* spp.), 例如 *Melanoplus devastator*; 乌苏里拟寰螽 (*Paratlanticus ussuriensis*); 沙漠蝗 (*Schistocerca gregaria*);

[0818] 虱目 (*Phthiraptera*) 的害虫, 例如, 毛虱属种 (*Damalinia* spp.)、血虱属种 (*Haematopinus* spp.)、毛虱属种 (*Linognathus* spp.)、虱属种 (*Pediculus* spp.)、葡萄根瘤蚜 (*Phylloxera vastatrix*)、阴虱 (*Phthirus pubis*)、啮毛虱属种 (*Trichodectes* spp.);

[0819] 啮虫目 (*Psocoptera*) 的害虫, 例如啮虫属种 (*Lepinotus* spp.)、书虱属种 (*Liposcelis* spp.);

[0820] 蚤目 (*Siphonaptera*) 的害虫, 例如角叶蚤属种 (*Ceratophyllus* spp.); 栉首蚤属种 (*Ctenocephalides* spp.), 例如犬栉首蚤 (*Ctenocephalides canis*)、猫栉首蚤 (*Ctenocephalides felis*); 人蚤 (*Pulex irritans*); 穿皮潜蚤 (*Tunga penetrans*); 印鼠客蚤 (*Xenopsylla cheopis*);

[0821] 缨翅目 (*Thysanoptera*) 的害虫, 例如玉米黄呆蓟马 (*Anaphothrips obscurus*); 稻蓟马 (*Baliothrips biformis*); *Chaetanaphothrips leeuweni*; 葡萄链蓟马 (*Drepanothrips reuteri*); *Enneothrips flavens*; 花蓟马属种 (*Frankliniella* spp.), 例如烟褐花蓟马 (*Frankliniella fusca*)、西花蓟马 (*Frankliniella occidentalis*)、梳缺花蓟马 (*Frankliniella schultzei*)、东方花蓟马 (*Frankliniella tritici*)、*Frankliniella vaccinii*、威廉期花蓟马 (*Frankliniella williamsi*); 网蓟马属种 (*Heliothrips* spp.); 温室条蓟马 (*Hercinothrips femoralis*); 卡蓟马属种 (*Kakothrips* spp.); 腹突皱针蓟马 (*Rhipiphorothrips cruentatus*); 硬蓟马属种 (*Scirtothrips* spp.); *Taeniothrips*

cardamomi;蓟马属种(*Thrips* spp.),例如棕榈蓟马(*Thrips palmi*)、烟蓟马(*Thrips tabaci*);

[0822] 衣鱼目(*Zygentoma*) (= 缨尾目(*Thysanura*)) 的害虫,例如栉衣鱼属种(*Ctenolepisma* spp.)、衣鱼(*Lepisma saccharina*)、盗火虫(*Lepismodes inquilinus*)、家衣鱼(*Thermobia domestica*);

[0823] 综合纲(*Symphyla*) 的害虫,例如么蚰属种(*Scutigera* spp.),例如白松虫(*Scutigera immaculata*);

[0824] 软体动物门(*Mollusca*),特别是双壳纲(*Bivalvia*) 的害虫,例如饰贝属种(*Dreissena* spp.);

[0825] 以及腹足纲(*Gastropoda*) 的害虫,例如阿勇括蛄属种(*Arion* spp.),例如*Arion ater* rufus;双脐螺属种(*Biomphalaria* spp.);小泡螺属种(*Bulinus* spp.);野蛞蝓属种(*Deroceras* spp.),例如光滑野蛞蝓(*Deroceras laeve*);土蜗属种(*Galba* spp.);椎实螺属种(*Lymnaea* spp.);钉螺属种(*Oncomelania* spp.);黄金螺属种(*Pomacea* spp.);琥珀螺属种(*Succinea* spp.);

[0826] 扁形动物门(*Platyhelminthes*) 和线虫门(*Nematoda*) 的动物寄生虫和人类寄生虫,例如猫圆线虫属种(*Aelurostrongylus* spp.);裂口线虫属种(*Amidostomum* spp.);钩口线虫属种(*Ancylostoma* spp.),例如十二指肠钩口线虫(*Ancylostoma duodenale*)、锡兰钩口线虫(*Ancylostoma ceylanicum*)、西钩口线虫(*Ancylostoma braziliensis*);管圆线虫属种(*Angiostrongylus* spp.);异尖属种(*Anisakis* spp.)、裸头绦虫属种(*Anoplocephala* spp.);蛔虫属种(*Ascaris* spp.);鸡蛔虫属种(*Ascaridia* spp.);贝利蛔线虫属种(*Baylisascaris* spp.);布鲁丝虫属种(*Brugia* spp.),例如马来布鲁丝虫(*Brugia malayi*)、帝汶丝虫(*Brugia timori*);仰口线虫属种(*Bunostomum* spp.);毛细线虫属种(*Capillaria* spp.);夏柏特线虫属种(*Chabertia* spp.);枝睾吸虫属种(*Clonorchis* spp.);古柏线虫属种(*Cooperia* spp.);环棘属种(*Crenosoma* spp.);杯口属种(*Cyathostoma* spp.);双腔吸虫属种(*Dicrocoelium* spp.);网尾线虫属种(*Dictyocaulus* spp.),例如丝状网尾线虫(*Dictyocaulus filaria*);裂头属种(*Diphyllbothrium* spp.),例如阔节裂头绦虫(*Diphyllbothrium latum*);复孔绦虫属种(*Dipylidium* spp.);恶丝虫属种(*Dirofilaria* spp.);龙线虫属种(*Dracunculus* spp.),例如麦地那龙线虫(*Dracunculus medinensis*);棘球属种(*Echinococcus* spp.),例如细粒棘球绦虫(*Echinococcus granulosus*)、多房棘球绦虫(*Echinococcus multilocularis*);棘口吸虫属种(*Echinostoma* spp.);蛲虫属种(*Enterobius* spp.),例如蠕形住肠蛲虫(*Enterobius vermicularis*);鞘线虫属种(*Eucoleus* spp.);片形属种(*Fasciola* spp.);片吸虫属种(*Fascioloides* spp.);姜片属种(*Fasciolopsis* spp.);丝状虫属种(*Filaroides* spp.);筒线属种(*Gongylonema* spp.);三代虫属种(*Gyrodactylus* spp.);丽线虫属种(*Habronema* spp.);血矛线虫属种(*Haemonchus* spp.);螺旋线虫属种(*Heligmosomoides* spp.);异刺线虫属种(*Heterakis* spp.);膜壳绦虫属种(*Hymenolepis* spp.),例如微小膜壳绦虫(*Hymenolepis nana*);猪圆形属种(*Hyostomylus* spp.);光丝虫属种(*Litomosoides* spp.);罗阿丝虫属种(*Loa* spp.),例如罗阿丝虫(*Loa Loa*);后圆线虫属种(*Metastrongylus* spp.);次睾吸虫属种(*Metorchis* spp.);中殖孔绦虫属种

(*Mesocestoides* spp.); 蒙尼茨绦虫属种 (*Moniezia* spp.); 缪勒线虫属种 (*Muellerius* spp.); 副裸头绦虫属种 (*Necator* spp.); 细颈线虫属种 (*Nematodirus* spp.); 日本圆线虫属种 (*Nippostrongylus* spp.); 结节线虫属种 (*Oesophagostomum* spp.); 沃鲁线虫属种 (*Ollulanus* spp.); 盘尾丝虫属种 (*Onchocerca* spp.), 例如旋盘尾丝虫 (*Onchocerca volvulus*); 后睾属种 (*Opisthorchis* spp.); Oslerus 属种; 胃线虫属种 (*Ostertagia* spp.); 尖尾线虫属种 (*Oxyuris* spp.); *Paracapillaria* 属种; 副丝虫属种 (*Parafilaria* spp.); 并殖吸虫属种 (*Paragonimus* spp.); 同端盘属种 (*Paramphistomum* spp.); 副裸头绦虫属种 (*Paranoplocephala* spp.); 副蛔虫属种 (*Parascaris* spp.); 栓尾线虫属种 (*Passalurus* spp.); 原圆线虫属种 (*Protostrongylus* spp.); 血吸虫属种 (*Schistosoma* spp.); 腹腔丝虫属种 (*Setaria* spp.); 旋毛线虫属种 (*Spirocerca* spp.); 冠丝虫属种 (*Stephanofilaria* spp.); 冠尾线属种 (*Stephanurus* spp.); 类圆线虫属种 (*Strongyloides* spp.), 例如氏类圆线虫 (*Strongyloides fuelleborni*)、粪类圆线虫 (*Strongyloides stercoralis*); 圆线虫属种 (*Strongylus* spp.); 开口虫属种 (*Syngamus* spp.); 带绦虫属种 (*Taenia* spp.), 例如牛肉绦虫 (*Taenia saginata*)、有钩绦虫 (*Taenia solium*); 背带线虫属种 (*Teladorsagia* spp.); 吸吮线虫属种 (*Thelazia* spp.); 弓蛔虫属种 (*Toxascaris* spp.); 弓蛔虫属种 (*Toxocara* spp.); 毛线虫属种 (*Trichinella* spp.), 例如旋毛线虫 (*Trichinella spiralis*)、本地毛线虫 (*Trichinella nativa*)、布氏毛线虫 (*Trichinella britovi*)、南方毛线虫 (*Trichinella nelsoni*)、*Trichinella pseudopsiralis*; 毛毕吸虫属种 (*Trichobilharzia* spp.); 毛圆线虫属种 (*Trichostrongylus* spp.); 鞭虫属种 (*Trichuris* spp.), 例如 *Trichuris trichuria*; 钩虫属种 (*Uncinaria* spp.); 吴策线虫属种 (*Wuchereria* spp.), 例如班氏吴策线虫 (*Wuchereria bancrofti*);

[0827] 线虫门 (*Nematoda*) 的植物害虫, 即植物寄生线虫, 尤其是野外垫刃属种 (*Aglenchus* spp.), 例如居农野外垫刃线虫 (*Aglenchus agricola*); 粒线虫属种 (*Anguina* spp.), 例如小麦粒线虫 (*Anguina tritici*); 滑刃线虫属种 (*Aphelenchoides* spp.), 例如花生滑刃线虫 (*Aphelenchoides arachidis*)、草莓滑刃线虫 (*Aphelenchoides fragariae*); 刺线虫属种 (*Belonolaimus* spp.), 例如细小细线虫 (*Belonolaimus gracilis*)、长尾刺线虫 (*Belonolaimus longicaudatus*)、诺顿刺线虫 (*Belonolaimus nortoni*); 伞滑刃属种 (*Bursaphelenchus* spp.), 例如 *Bursaphelenchus cocophilus*、*Bursaphelenchus eremus*、松材线虫 (*Bursaphelenchus xylophilus*); 轮线虫属种 (*Cacopaurus* spp.), 例如瘟疫坏死线虫 (*Cacopaurus pestis*); 小环线虫属种 (*Criconemella* spp.), 例如弯曲小环线虫 (*Criconemella curvata*)、刻线小环线虫 (*Criconemella onoensis*)、装饰小环线虫 (*Criconemella ornata*)、*Criconemella rusium*、薄叶小环线虫 (*Criconemella xenoplax* (= *Mesocriconema xenoplax*)); 轮线虫属种 (*Criconemoides* spp.), 例如 *Criconemoides ferniae*、*Criconemoides onoense*、*Criconemoides ornatum*; 茎线虫属种 (*Ditylenchus* spp.), 例如鳞球茎茎线虫 (*Ditylenchus dipsaci*); 锥线虫属种 (*Dolichodorus* spp.); 球异皮线虫属种 (*Globodera* spp.), 例如马铃薯白线虫 (*Globodera pallida*)、马铃薯金线虫 (*Globodera rostochiensis*); 螺旋线虫属种 (*Helicotylenchus* spp.), 例如柯柏螺旋线虫

(*Helicotylenchus dihystra*);半轮线虫属种(*Hemicriconemoides* spp.);鞘线虫属种(*Hemicyclophora* spp.);异皮线虫属种(*Heterodera* spp.),例如小麦禾谷胞囊线虫(*Heterodera avenae*)、大豆异皮线虫(*Heterodera glycines*)、甜菜胞囊线虫(*Heterodera schachtii*);潜根线虫属种(*Hirschmaniella* spp.);纽带线虫属种(*Hoplolaimus* spp.);长针线虫属种(*Longidorus* spp.),例如非洲长针线虫(*Longidorus africanus*);根结线虫属种(*Meloidogyne* spp.),例如奇特伍德虫瘿线虫(*Meloidogyne chitwoodi*)、*Meloidogyne fallax*、北方根结线虫(*Meloidogyne hapla*)、南方根结线虫(*Meloidogyne incognita*);瓢线虫属种(*Meloinema* spp.);珍珠线虫属种(*Nacobbus* spp.);拟茎线虫属种(*Neotylenchus* spp.);拟长针线虫属种(*Paralongidorus* spp.);拟滑刃线虫(*Paraphelenchus* spp.);异毛刺属种(*Paratrichodorus* spp.),例如微小拟毛刺线虫(*Paratrichodorus minor*);针线虫属种(*Paratylenchus* spp.);短体线虫(*Pratylenchus* spp.),例如穿刺短体线虫(*Pratylenchus penetrans*);*Pseudohalenchus*属种;平滑垫刃属种(*Psilenchus* spp.);*Punctodera*属种;矮化线虫属种(*Quinisulcius* spp.);穿孔线虫属种(*Radopholus* spp.),例如柑橘穿孔线虫(*Radopholus citrophilus*)、相似穿孔线虫(*Radopholus similis*);盘旋线虫属种(*Rotylenchulus* spp.);盘旋线虫属种(*Rotylenchus* spp.);盾线虫属种(*Scutellonema* spp.);亚蛇形线虫属种(*Subanguina* spp.);毛刺线虫属种(*Trichodorus* spp.),例如钝头毛刺线虫(*Trichodorus obtusus*)、原始毛刺线虫(*Trichodorus primitivus*);矮化线虫属种(*Tylenchorhynchus* spp.),例如饰环矮化线虫(*Tylenchorhynchus annulatus*);小垫刃属种(*Tylenchulus* spp.),例如半穿刺线虫(*Tylenchulus semipenetrans*);剑线虫属种(*Xiphinema* spp.),例如标记剑线虫(*Xiphinema index*)。

[0828] 此外,可以防治原生动物(Protozoa)亚界、球虫目(Coccidia)的害虫,例如艾美球虫属种(*Eimeria* spp.)。

[0829] 在特定的浓度或施用率下,式(I)的化合物还可任选地用作除草剂、安全剂、生长调节剂或改进植物特性的试剂,用作杀微生物剂或杀配子剂,例如用作杀真菌剂、抗霉菌剂、杀细菌剂、杀病毒剂(包括抗类病毒的试剂)或用作抗MLO(类支原体生物体)和RLO(类立克次氏体生物体)的试剂。根据具体情况,它们还可用于合成其他活性化合物的中间体或前体。

[0830] 制剂

[0831] 本发明还涉及作为农药的制剂和由其制备的使用形式,例如浸液、滴液和喷液,其包含至少一种式(I)的化合物。任选地,使用形式还包含其他农药和/或改善作用的佐剂,例如渗透剂,如植物油(如菜籽油、葵花油)、矿物油(如石蜡油)、植物脂肪酸的烷基酯(如菜籽油甲酯或大豆油甲酯)或烷醇烷氧基化物;和/或展着剂(spreaders),例如烷基硅氧烷和/或盐,如有机或无机铵盐或磷盐(如硫酸铵或磷酸氢二铵);和/或保持促进剂,例如磺基琥珀酸二辛酯或羟丙基瓜尔胶聚合物;和/或湿润剂,例如丙三醇;和/或肥料,例如含有铵、钾或磷的肥料。

[0832] 常规制剂例如为水溶性液剂(SL)、乳液浓缩剂(EC)、水乳剂(EW)、悬浮浓缩剂(SC、SE、FS、OD)、水分散性粒剂(WG)、颗粒剂(GR)和胶囊浓缩剂(CS);这些和其他可能的制剂类型例如由国际作物生命组织(Crop Life International)记载,以及记载于农药手册

(Pesticide Specifications)、联合国粮农组织和世界卫生组织农药说明书开发与使用手册(Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides)、联合国粮农组织植物生产和保护文件-173(FAO Plant Production and Protection Papers-173)(由联合国粮农组织和世界卫生组织关于农药说明书的联合会议制订,2004,ISBN:9251048576)。除了一种或多种式(I)的化合物之外,所述制剂还任选地包含其他农用化学活性化合物。

[0833] 优选包含助剂的制剂或使用形式,所述助剂为例如增量剂、溶剂、自发性促进剂、载体、乳化剂、分散剂、防冻剂、杀生物剂(biocide)、增稠剂和/或其他助剂,例如佐剂。本文中的佐剂为增强制剂的生物学作用而其本身不具有任何生物学作用的组分。佐剂的实例为促进保留、铺展、叶面粘附或渗透的试剂。

[0834] 这些制剂以已知方式制备,例如通过将式(I)的化合物与助剂混合,所述助剂为例如增量剂、溶剂和/或固体载体和/或其他助剂,例如表面活性剂。所述制剂在合适的设备中制备,或在施用之前或施用期间制备。

[0835] 所使用的助剂可为这样的物质:其适合于将特定特性如某些物理、技术和/或生物学特性赋予式(I)的化合物的制剂,或由这些制剂制得的使用形式(例如即用型(ready-to-use)农药,如喷液或拌种产品)。

[0836] 合适的增量剂为例如水、极性和非极性有机化学液体,其例如选自:芳族烃和非芳族烃(例如链烷烃、烷基苯、烷基萘、氯苯)、醇和多元醇(如果合适,其还可被取代、醚化和/或酯化)、酮(例如丙酮、环己酮)、酯(包括脂肪和油)以及(多)醚、简单的和取代的胺、酰胺、内酰胺(例如N-烷基吡咯烷酮)和内酯、砜和亚砜(例如二甲基亚砜)。

[0837] 如果所使用的增量剂为水,则还可以使用例如有机溶剂作为助溶剂。有用的液体溶剂主要为:芳族化合物,例如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯代芳族化合物或氯代脂族烃,例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,例如环己烷或链烷烃,如矿物油馏分、矿物油和植物油;醇,例如丁醇或乙二醇以及它们的醚和酯;酮,例如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂,例如二甲基甲酰胺和二甲基亚砜;以及水。

[0838] 原则上,可以使用所有合适的溶剂。合适的溶剂的实例为芳族烃,例如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯代芳族烃或脂族烃,例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,例如环己烷、链烷烃、矿物油馏分、矿物油和植物油;醇,例如甲醇、乙醇、异丙醇、丁醇或乙二醇以及它们的醚和酯;酮,例如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂,例如二甲基亚砜;以及水。

[0839] 原则上,可以使用所有合适的载体。有用的载体尤其包括:例如铵盐;和研磨的天然矿物,例如高岭土、黏土、滑石、白垩、石英、绿坡缕石、蒙脱石或硅藻土;及研磨的合成矿物,例如细分散的二氧化硅、氧化铝;以及天然的或合成的硅酸盐、树脂、蜡和/或固体肥料。还可使用这些载体的混合物。用于颗粒剂的有用载体包括:例如粉碎并分级的天然岩石,例如方解石、大理石、浮石、海泡石、白云石;以及无机粉和有机粉的合成颗粒;以及有机材料(例如锯屑、纸、椰壳、玉米穗轴和烟草茎)的颗粒。

[0840] 还可使用液化的气体增量剂或溶剂。特别合适的增量剂或载体为在标准温度和大气压下为气体的那些,例如气溶胶推进剂如卤代烃,以及丁烷、丙烷、氮气和二氧化碳。

[0841] 具有离子或非离子特性的乳化剂和/或发泡剂(foam former)、分散剂或润湿剂或

这些表面活性物质的混合物的实例为聚丙烯酸的盐；木质素磺酸的盐；苯酚磺酸或萘磺酸的盐；环氧乙烷与脂肪醇或与脂肪酸或与脂肪胺、与取代的酚（优选烷基酚或芳基酚）的缩聚物；磺基琥珀酸酯的盐；牛磺酸衍生物（优选牛磺酸烷基酯）；聚乙氧基化的醇或酚的磷酸酯；多元醇的脂肪酸酯；以及含有硫酸酯、磺酸酯和磷酸酯的化合物的衍生物，例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸酯、烷基硫酸酯、芳基磺酸酯、蛋白质水解物、木质素亚硫酸盐（lignosulphite）废液和甲基纤维素。如果式（I）的化合物之一和/或惰性载体之一不溶于水并且如果在水中进行施用，则表面活性剂的存在是有利的。

[0842] 可存在于制剂和由此衍生的使用形式中的其他助剂为染料，例如无机颜料（如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝）和有机染料（如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料）；以及营养物和微量营养物，例如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

[0843] 可存在的另外的组分为稳定剂（例如冷稳定剂）、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂或改善化学和/或物理稳定性的其他试剂。还可存在发泡剂或消泡剂。

[0844] 此外，所述制剂及由此衍生的使用形式还可包含下列物质作为另外的助剂：粘着剂（例如羧甲基纤维素）；粉状、颗粒状或胶乳状的天然的和合成的聚合物（例如阿拉伯树胶、聚乙烯醇、聚乙酸乙烯酯），或天然磷脂（例如脑磷脂和卵磷脂），以及合成磷脂。其他助剂可为矿物油和植物油。

[0845] 如果适当，所述制剂及由其衍生的使用形式中还可存在其他助剂。这些添加剂的实例为香料、保护性胶体、粘结剂、粘合剂、增稠剂、触变剂、渗透剂、保持促进剂、稳定剂、螯合剂、络合剂、湿润剂、展着剂。通常，式（I）的化合物可与常用于制剂目的的任何固体添加剂或液体添加剂结合。

[0846] 有用的保持促进剂包括所有那些降低动态表面张力的物质（如磺基琥珀酸二辛酯）或增加粘弹性的物质（如羟丙基瓜尔胶聚合物）。

[0847] 本文中有用的渗透剂为所有那些常用于促进活性农用化学成分渗透到植物内的物质。在本文中，渗透剂定义为其能从（通常是含水的）施用液体和/或从喷雾涂层渗透至植物的表皮从而提高活性化合物在表层中的迁移性。文献（Baur等人，1997，Pesticide Science 51, 131-152）中记载的方法可用于测定此特性。实例包括醇烷氧基化物，例如椰子脂肪乙氧基化物（10）或异十三烷基乙氧基化物（12）；脂肪酸酯，例如菜籽油甲酯或大豆油甲酯；脂肪胺烷氧基化物，例如牛油脂肪胺乙氧基化物（15）；或铵盐和/或磷盐，例如硫酸铵或硫酸氢二铵。

[0848] 所述制剂优选包含0.00000001重量%至98重量%的式（I）的化合物，更优选包含0.01重量%至95重量%的式（I）的化合物，最优选包含0.5重量%至90重量%的式（I）的化合物，基于所述制剂的重量计。

[0849] 在由所述制剂制备的使用形式（特别是农药）中，式（I）的化合物的含量可在宽范围内变化。在使用形式中，式（I）的化合物的浓度通常可为0.00000001重量%至95%重量的式（I）化合物，优选0.00001重量%至1重量%，基于所述使用形式的重量计。施用以适合于使用形式的常规方式完成。

[0850] 混合物

[0851] 式（I）的化合物还可以与一种或多种合适的下列物质混合使用：杀真菌剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀软体动物剂、杀线虫剂、杀昆虫剂、微生物剂（microbiological agent）、有益

生物体 (beneficial organisms)、除草剂、肥料、驱鸟剂、植物性毒素 (phytotonic)、止繁殖剂 (sterilant)、安全剂、化学信息素和/或植物生长调节剂,从而由此例如拓宽作用谱、延长作用时间、增加作用速率、防止排斥或防止抗性发展。此外,这类活性化合物组合可改善植物生长和/或提高对非生物因子 (例如高温或低温、干旱或增加的含水量或土壤盐度) 的耐受性。还可以改善开花和结果的性能、优化发芽能力和根发育、促进采收并提高产量、影响成熟、提高采收产品的品质和/或营养价值、延长采收产品的储存寿命和/或提高其可加工性。

[0852] 此外,式 (I) 的化合物可以与其他活性化合物或化学信息素 (如引诱剂和/或驱鸟剂和/或植物激活剂和/或生长调节剂和/或肥料) 混合存在。同样,式 (I) 的化合物可以与改善植物特性 (例如生长、采收物的产量和品质) 的试剂混合使用。

[0853] 在本发明的一个特定的实施方案中,式 (I) 的化合物与其他化合物 (优选如下文所述的那些) 混合存在于制剂或由这些制剂制备的使用形式中。

[0854] 如果下述化合物之一可以不同的互变异构形式存在,则这些形式也包括在内,即使各自没有明确提及。

[0855] 杀昆虫剂/杀螨剂/杀线虫剂

[0856] 本文中以其通用名称说明的活性成分是已知的,并记载于例如“The Pesticide Manual”,第16版,British Crop Protection Concil 2012中,或可在互联网 (例如 <http://www.alanwood.net/pesticides>) 上检索到。

[0857] (1) 乙酰胆碱酯酶 (AChE) 抑制剂,例如,氨基甲酸酯类,例如棉铃威 (alanycarb)、涕灭威 (aldicarb)、噁虫威 (bendiocarb)、丙硫克百威 (benfuracarb)、丁酮威 (butocarboxim)、丁酮砜威 (butoxycarboxim)、甲萘威 (carbaryl)、克百威 (carbofuran)、丁硫克百威 (carbosulfan)、乙硫苯威 (ethiofencarb)、丁苯威 (fenobucarb)、伐虫脒 (formetanate)、呋线威 (furathiocarb)、异丙威 (isoprocarb)、甲硫威 (methiocarb)、灭多威 (methomyl)、速灭威 (metolcarb)、杀线威 (oxamyl)、抗蚜威 (pirimicarb)、残杀威 (propoxur)、硫双威 (thiodicarb)、久效威 (thiofanox)、啮蚜威 (triazamate)、混杀威 (trimethacarb)、XMC和灭杀威 (xylylcarb);或者

[0858] 有机磷酸酯类,例如乙酰甲胺磷 (acephate)、甲基吡啶磷 (azamethiphos)、益棉磷 (azinphos-ethyl)、甲基谷硫磷 (azinphos-methyl)、硫线磷 (cadusafos)、毒虫畏 (chlorfenvinphos)、氯甲硫磷 (chlormephos)、毒死蜱 (chloropyrifos)、甲基毒死蜱 (chloropyrifos-methyl)、蝇毒磷 (coumaphos)、杀螟腈 (cyanophos)、甲基内吸磷 (demeton-S-methyl)、二嗪农 (diazinon)、敌敌畏/DDVP (dichlorvos/DDVP)、百治磷 (dicrotophos)、乐果 (dimethoate)、甲基毒虫畏 (dimethylvinphos)、乙拌磷 (disulfoton)、苯硫磷 (EPN)、乙硫磷 (ethion)、灭线磷 (ethoprophos)、伐灭磷 (famphur)、苯线磷 (fenamiphos)、杀螟硫磷 (fenitrothion)、倍硫磷 (fenthion)、噁唑磷 (fosthiazate)、庚烯磷 (heptenophos)、imicyafos、异柳磷 (isofenphos)、O-(甲氧基氨基硫代磷酰基) 水杨酸异丙酯、异噁唑啉 (isoxathion)、马拉硫磷 (malathion)、灭蚜磷 (mecarbam)、甲胺磷 (methamidophos)、杀扑磷 (methidathion)、速灭磷 (mevinphos)、久效磷 (monocrotophos)、二溴磷 (naled)、氧化乐果 (omethoate)、亚砷磷 (oxydemeton-methyl)、对硫磷 (parathion)、甲基对硫磷 (parathion-methyl)、稻丰散 (phenthoate)、甲

拌磷(phorate)、伏杀硫磷(phosalone)、亚胺硫磷(phosmet)、磷胺(phosphamidon)、膦肟磷(phoxim)、甲基嘧啶磷(pirimiphos-methyl)、丙溴磷(profenofos)、胺丙畏(propetamphos)、丙硫磷(prothiofos)、吡唑硫磷(pyraclufos)、哒嗪硫磷(pyridaphenthion)、喹硫磷(quinalphos)、治螟磷(sulfotep)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、双硫磷(temephos)、特丁硫磷(terbufos)、杀虫畏(tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷(thiometon)、三唑磷(triazophos)、敌百虫(triclorfon)和蚜灭磷(vamidothion)。

[0859] (2) GABA门控氯离子通道拮抗剂,例如环戊二烯有机氯类,例如氯丹(chlordane)和硫丹(endosulphan);或苯基吡唑类(fiprole),例如乙虫腈(ethiprole)和氟虫腈(fipronil)。

[0860] (3) 钠通道调节剂/电压门控钠通道阻断剂,例如拟除虫菊酯类,例如氟丙菊酯(acrinathrin)、烯丙菊酯(allethrin)、d-顺-反烯丙菊酯(d-cis-trans allethrin)、d-反烯丙菊酯(d-trans allethrin)、联苯菊酯(bifenthrin)、生物烯丙菊酯(bioallethrin)、生物烯丙菊酯S-环戊烯基异构体、生物苄呋菊酯(bioresmethrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、氟氯氰菊酯(cyfluthrin)、β-氟氯氰菊酯(beta-cyfluthrin)、氟氯氰菊酯(cyhalothrin)、λ-氟氯氰菊酯(lambda-cyhalothrin)、γ-氟氯氰菊酯(gamma-cyhalothrin)、氯氰菊酯(cypermethrin)、α-氯氰菊酯(alpha-cypermethrin)、β-氯氰菊酯(beta-cypermethrin)、θ-氯氰菊酯(theta-cypermethrin)、ζ-氯氰菊酯(zeta-cypermethrin)、苯醚氰菊酯[(1R)-反式异构体](cyphenothrin[(1R)-trans isomers])、溴氰菊酯(deltamethrin)、烯炔菊酯[(EZ)-(1R)异构体](empenthrin[(EZ)-(1R) isomers])、高氰戊菊酯(esfenvalerate)、醚菊酯(etofenprox)、甲氰菊酯(fenpropathrin)、氰戊菊酯(fenvalerate)、氟氰戊菊酯(flucythrinate)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、τ-氟胺氰菊酯(tau-fluvalinate)、苄螨醚(halfenprox)、炔咪菊酯(imiprothrin)、噻恩菊酯(kadethrin)、momfluorothrin、苄氯菊酯(permethrin)、苯醚菊酯[(1R)-反式异构体](phenothrin[(1R)-trans isomer])、炔丙菊酯(prallethrin)、除虫菊酯(除虫菊)(pyrethrins(pyrethrum))、灭虫菊(resmethrin)、氟硅菊酯(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin)、胺菊酯(tetramethrin)、胺菊酯[(1R)异构体]、四溴菊酯(tralomethrin)和四氟苯菊酯(transfluthrin);或DDT;或甲氧氯。

[0861] (4) 烟碱型(Nicotinergic)乙酰胆碱受体(nAChR)激动剂,例如新烟碱类(neonicotinoids),例如啉虫脒(acetamiprid)、噻虫胺(clothianidin)、呋虫胺(dinotefuran)、吡虫啉(imidacloprid)、烯啉虫胺(nitenpyram)、噻虫啉(thiacloprid)和噻虫嗪(thiamethoxam);或者烟碱或氟啉虫胺腈(sulphoxaflor)或氟吡呋喃酮(flupyradifurone)。

[0862] (5) 烟碱型乙酰胆碱受体(nAChR)的变构活化剂,例如多杀菌素(spinosyns),例如乙基多杀菌素(spinetoram)和多杀霉素(spinosad)。

[0863] (6) 氯离子通道活化剂,例如阿维菌素类(avermectins)/米尔贝霉素类(milbemycins),例如阿维菌素(abamectin)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐(emamectinbenzoate)、霉皮菌素(lepimectin)和弥拜菌素(milbemectin)。

[0864] (7) 保幼激素模拟剂(Juvenile hormone imitator),例如保幼激素类似物,例如

烯虫乙酯(hydroprene)、烯虫炔酯(kinoprene)和烯虫酯(methoprene),或苯氧威(fenoxycarb)或吡丙醚(pyriproxyfen)。

[0865] (8) 具有未知的或不明确的作用机理的活性化合物,例如卤代烷,例如溴代甲烷和其他卤代烷;或三氯硝基甲烷(chloropicrine)或硫酰氟(sulphuryl fluoride)或硼砂或吐酒石。

[0866] (9) 选择性拒食剂,例如吡蚜酮(pymetrozine)或氟啶虫酰胺(flonicamid)。

[0867] (10) 螨生长抑制剂,例如四螨嗪(clofentezine)、噻螨酮(hexythiazox)和氟螨嗪(diflovidazin)或乙螨唑(etoxazole)。

[0868] (11) 昆虫肠膜的微生物干扰剂,例如苏云金芽孢杆菌以色列亚种(*Bacillus thuringiensis* subspecies *israelensis*)、球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus*)、苏云金芽孢杆菌鮎泽亚种(*Bacillus thuringiensis* subspecies *aizawai*)、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(*Bacillus thuringiensis* subspecies *kurstaki*)、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种(*Bacillus thuringiensis* subspecies *tenebrionis*)和BT植物蛋白:Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab1。

[0869] (12) 氧化磷酸化抑制剂、ATP干扰剂,例如丁醚脲(diafenthiuron);或有机锡化合物,例如三唑锡(azocyclotin)、三环锡(cyhexatin)和苯丁锡(fenbutatin oxide);或克螨特(propargite)或四氯杀螨砜(tetradifon)。

[0870] (13) 间断H⁺质子梯度的氧化磷酸化解偶联剂,例如虫螨腈(chlorfenapyr)、二硝甲酚(DNOC)和氟虫胺(sulphluramid)。

[0871] (14) 烟碱型乙酰胆碱受体拮抗剂,例如杀虫磺(bensultap)、杀螟丹盐酸盐(cartaphydrochloride)、杀虫环(thiocyclam)和杀虫双(thiosultap-sodium)。

[0872] (15) 几丁质生物合成抑制剂,0型,例如双三氟虫脲(bistrifluron)、定虫隆(chlofluazuron)、除虫脲(diflubenzuron)、氟环脲(flucycloxuron)、氟虫脲(flufenoxuron)、氟铃脲(hexaflumuron)、虱螨脲(lufenuron)、氟酰胺(novaluron)、多氟脲(noviflumuron)、氟苯脲(teflubenzuron)和杀虫隆(triflumuron)。

[0873] (16) 几丁质生物合成抑制剂,1型,例如,例如噻嗪酮(buprofezin)。

[0874] (17) 蜕皮抑制剂(尤其是双翅目,即双翅类昆虫),例如灭蝇胺(cyromazine)。

[0875] (18) 蜕皮激素受体激动剂,例如环虫酰肼(chromafenozide)、氯虫酰肼(halofenozide)、甲氧虫酰肼(methoxyfenozide)和虫酰肼(tebufenozide)。

[0876] (19) 章鱼胺能激动剂,例如双甲脒(amitraz)。

[0877] (20) 复合物-III电子转移抑制剂,例如氟蚁腓(hydramethylnon)或灭螨醌(acequinocyl)或啉螨酯(flucacrypyrim)。

[0878] (21) 复合物-I电子转移抑制剂类,例如METI杀螨剂,例如喹螨醚(fenazaquin)、啉螨酯(fenpyroximate)、啉螨醚(pyrimidifen)、吡啶灵(pyridaben)、吡螨胺(tebufenpyrad)和啉虫酰胺(tolfenpyrad),或鱼藤酮(rotenone)(鱼藤属(Derris))。

[0879] (22) 电压门控钠通道阻断剂,例如噁二唑虫(indoxacarb)或氰氟虫腚(metaflumizone)。

[0880] (23) 乙酰基-CoA羧化酶抑制剂,例如特窗酸和特特拉姆酸衍生物,例如螺螨酯(spirodiclofen)、螺甲螨酯(spiromesifen)和螺虫乙酯(spirotetramat)。

[0881] (24) 复合物-IV电子转移抑制剂类,例如膦类化合物,如磷化铝、磷化钙、膦和磷化锌;或氰化物。

[0882] (25) 复合物-II电子转移抑制剂,例如腈吡螨酯(cyenopyrafen)和丁氟螨酯(cyflumetofen)。

[0883] (28) 兰尼碱(ryanodine)受体效应物,例如二酰胺,如氯虫苯甲酰胺(chlorantraniliprole)、溴氰虫酰胺(cyantraniliprole)和氟虫双酰胺(flubendiamide)。

[0884] 具有未知或不明确的作用机理的其他活性化合物,例如afidopyropen、afoxolaner、印楝素(azadirachtin)、benclothiaz、苯螨特(benzoximate)、联苯肼酯(bifenazate)、溴螨酯(bromopropylate)、灭螨锰(chinomethionat)、冰晶石(cryolite)、cyclaniliprole、环氧虫啉(cycloxaprid)、cyhalodiamide、dicloromezotiaz、三氯杀螨醇(dicofol)、氟螨啉(diflovidazin)、flometoquin、氟噻虫砒(fluensulfone)、噁虫胺(flufenerim)、氟菌螨酯(flufenoxystrobin)、丁烯氟虫腈(flufiprole)、fluhexafon、氟吡菌酰胺(fluopyram)、fluralaner、呋喃虫酰肼(fufenozide)、戊吡虫胍(guadipyr)、heptafluthrin、氯噻啉(imidaclothiz)、异菌脲(iprodione)、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、哌虫啉(paichongding)、pyflubumide、三氟甲吡醚(pyridalyl)、pyrifluquinazon、噁螨胺(pyriminostrobin)、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)、tetrailiprole、tetrachlorantraniliprole、tioazafen、triflumezopyrim和碘甲烷;此外还有基于坚强芽孢杆菌(*Bacillus firmus*) (I-1582, BioNeem, Votivo)的制剂,以及下列已知的活性化合物:1-{2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亚磺酰基]苯基}-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺(已知于W02006/043635)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吡啶-3,4'-哌啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮(已知于W02003/106457)、2-氯-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]哌啶-4-基}-4-(三氟甲基)苯基]异烟酰胺(已知于W02006/003494)、3-(2,5-二甲基苯基)-4-羟基-8-甲氧基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(已知于W02009/049851)、3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基碳酸乙酯(已知于W02009/049851)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基哌啶-1-基)-5-氟嘧啶(已知于W02004/099160)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3-氯苯基)嘧啶(已知于W02003/076415)、PF1364(CAS登记号1204776-60-2)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)-5-氯-3-甲基苯甲酰基]-2-甲基肼甲酸甲酯(已知于W02005/085216)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)-5-氰基-3-甲基苯甲酰基]-2-乙基肼甲酸甲酯(已知于W02005/085216)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)-5-氰基-3-甲基苯甲酰基]-2-甲基肼甲酸甲酯(已知于W02005/085216)、2-[3,5-二溴-2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)苯甲酰基]-2-乙基肼甲酸甲酯(已知于W02005/085216)、N-[2-(5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-甲酰胺(已知于CN102057925)、8-氯-N-[(2-氯-5-甲氧基苯基)磺酰基]-6-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡啶-2-甲酰胺(已知于W02010/129500)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-(1-氧化硫杂环丁烷(oxidothietan)-3-基)苯甲酰胺(已知于W02009/080250)、N-[(2E)-1-[(6-氯吡啶-3-基)

甲基]吡啶-2(1H)-亚基]-2,2,2-三氟乙酰胺(已知于W02012/029672)、1-[(2-氯-1,3-噻唑-5-基)甲基]-4-氧-3-苯基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶-1-鎓-2-醇化物(已知于W02009/099929)、1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-4-氧代-3-苯基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶-1-鎓-2-醇化物(已知于W02009/099929)、4-(3-{2,6-二氯-4-[(3,3-二氯丙-2-烯-1-基)氧基]苯氧基}丙氧基)-2-甲氧基-6-(三氟甲基)嘧啶(已知于CN101337940)、N-[2-(叔丁基氨基甲酰基)-4-氯-6-甲基苯基]-1-(3-氯吡啶-2-基)-3-(氟甲氧基)-1H-吡啶-5-甲酰胺(已知于W02008/134969)、3-[苯甲酰基(甲基)氨基]-N-[2-溴-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]-6-(三氟甲基)苯基]-2-氟苯甲酰胺(已知于W0 2010018714)、[2-(2,4-二氯苯基)-3-氧-4-氧杂螺[4.5]癸-1-烯-1-基]碳酸丁酯(已知于CN 102060818)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噻唑-3-基]-N-[(Z)-甲氧基亚氨基甲基]-2-甲基苯甲酰胺(已知于W02007/026965)、3E)-3-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-吡啶亚基]-1,1,1-三氟丙-2-酮(已知于W02013/144213)、N-(甲基磺酰基)-6-[2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]吡啶-2-羧酰胺(已知于W02012/000896)、N-[3-(苄基氨基甲酰基)-4-氯苯基]-1-甲基-3-(五氟乙基)-4-(三氟甲基)-1H-吡啶-5-羧酰胺(已知于W02010/051926)。

[0885] 杀真菌剂

[0886] 本文中以其通用名称说明的活性成分为已知的且记载于例如“Pesticide Manual”中或互联网(例如:<http://www.alanwood.net/pesticides>)上。

[0887] 如果存在合适的官能团,则(1)至(15)类中列出的所有杀真菌混合组分可任选地与相应的碱或酸形成盐。此外,如果互变异构是可行的,则(1)至(15)类中列出的杀真菌混合组分还包括互变异构形式。

[0888] 1) 麦角固醇生物合成抑制剂,例如(1.01)4-十二烷基-2,6-二甲基吗啉(aldimorph)、(1.02)阿扎康唑(azaconazole)、(1.03)双苯三唑醇(bitertanol)、(1.04)糠菌唑(bromuconazole)、(1.05)环唑醇(cyproconazole)、(1.06)苄氯三唑醇(diclobutrazole)、(1.07)苯醚甲环唑(difenoconazole)、(1.08)烯唑醇(diniconazole)、(1.09)烯唑醇(diniconazole-M)、(1.10)十二环吗啉(dodemorph)、(1.11)十二环吗啉乙酸盐(dodemorph acetate)、(1.12)氟环唑(epoxiconazole)、(1.13)乙环唑(etaconazole)、(1.14)氯苯嘧啶醇(fenarimol)、(1.15)腈苯唑(fenbuconazole)、(1.16)环酰菌胺(fenhexamide)、(1.17)苯锈啶(fenpropidin)、(1.18)丁苯吗啉(fenpropimorph)、(1.19)氟喹唑(flquinconazole)、(1.20)呋咪唑(flurprimidol)、(1.21)氟硅唑(flusilazole)、(1.22)粉唑醇(flutriafol)、(1.23)呋菌唑(furconazole)、(1.24)呋醚唑(furconazole-cis)、(1.25)己唑醇(hexaconazole)、(1.26)抑霉唑(imazalil)、(1.27)烯菌灵(imazalil sulphate)、(1.28)亚胺唑(imibenconazole)、(1.29)种菌唑(ipconazole)、(1.30)叶菌唑(metconazole)、(1.31)腈菌唑(myclobutanil)、(1.32)萘替芬(naftifine)、(1.33)氟苯嘧啶醇(nuarimol)、(1.34)噁咪唑(oxpoconazole)、(1.35)多效唑(paclobutrazole)、(1.36)稻瘟酯(pefurazoate)、(1.37)戊菌唑(penconazole)、(1.38)粉病灵(piperazin)、(1.39)咪鲜胺(prochloraz)、(1.40)丙环唑(propiconazole)、(1.41)丙硫菌唑(prothioconazole)、(1.42)稗草丹(pyributicarb)、(1.43)啉斑肟(pyrifenoxy)、(1.44)唑啉菌酮(quinconazole)、(1.45)硅氟唑(simeconazole)、(1.46)螺环菌胺(spiroxamine)、(1.47)戊唑醇(tebuconazole)、(1.48)特比萘芬(terbinafin)、(1.49)四氟醚唑

(tetraconazole)、(1.50) 三唑酮(triadimefon)、(1.51) 唑菌醇(triadimenol)、(1.52) 十三吗啉(tridemorph)、(1.53) 氟菌唑(triflumizole)、(1.54) 噻菌灵(triforin)、(1.55) 灭菌唑(triticonazole)、(1.56) 烯效唑(uniconazole)、(1.57) 精烯效唑(uniconazole-p)、(1.58) 烯霜苄唑(viniconazole)、(1.59) 伏立康唑(voriconazole)、(1.60) 1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基) 环庚醇、(1.61) 1-(2,2-二甲基-2,3-二氢-1H-茚-1-基)-1H-咪唑-5-羧酸甲酯、(1.62) N'-{5-(二氟甲基)-2-甲基-4-[3-(三甲基甲硅烷基) 丙氧基] 苯基}-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(1.63) N-乙基-N-甲基-N'-{2-甲基-5-(三氟甲基)-4-[3-(三甲基甲硅烷基) 丙氧基] 苯基} 亚氨基甲酰胺、(1.64) 0-[1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁-2-基] 1H-咪唑-1-硫代羧酸酯(carbothioate)、(1.65) 啉菌噁唑(pyrisoxazole)、(1.66) 2-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.67) 1-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.68) 5-(烯丙基硫烷基)-1-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-1H-1,2,4-三唑、(1.69) 2-[1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.70) 2-{[rel (2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.71) 2-{[rel (2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.72) 1-{[rel (2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.73) 1-{[rel (2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.74) 5-(烯丙基硫烷基)-1-{[rel (2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-1H-1,2,4-三唑、(1.75) 5-(烯丙基硫烷基)-1-{[rel (2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基) 环氧乙烷-2-基] 甲基}-1H-1,2,4-三唑、(1.76) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.77) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.78) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.79) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.80) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.81) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.82) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.83) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.84) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基) 苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基) 丙-2-醇、(1.85) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基) 苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基) 丁-2-醇、(1.86) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基) 苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基) 戊-2-醇、(1.87) 2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基) 苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基) 丁-2-醇、(1.88) 2-[2-氯-4-(2,4-二氯苯氧基) 苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基) 丙-2-醇、(1.89) (2R)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基) 丁-2-醇、(1.90) (2R)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基) 丁-2-醇、(1.91) (2S)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-

1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.92) (2S)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.93) (1S,2R,5R)-5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇、(1.94) (1R,2S,5S)-5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇、(1.95) 5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇。

[0889] 2) 呼吸链复合物I或II抑制剂,例如(2.01) 联苯吡菌胺(bixafen)、(2.02) 啉酰菌胺(boscalid)、(2.03) 萎锈灵(carboxin)、(2.04) 氟嘧菌胺(diflumetorim)、(2.05) 甲呋酰胺(fenfuram)、(2.06) 氟吡菌酰胺(fluopyram)、(2.07) 氟酰胺(flutolanil)、(2.08) 氟唑菌酰胺(fluxapyroxad)、(2.09) 呋吡菌胺(furametpyr)、(2.10) 拌种胺(furmecyclox)、(2.11) 吡唑萘菌胺(isopyrazam) (顺式差向异构外消旋体1RS,4SR,9RS与反式差向异构外消旋体1RS,4SR,9SR的混合物)、(2.12) 吡唑萘菌胺(反式差向异构外消旋体1RS,4SR,9SR)、(2.13) 吡唑萘菌胺(反式差向异构对映体1R,4S,9S)、(2.14) 吡唑萘菌胺(反式差向异构对映体1S,4R,9R)、(2.15) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构外消旋体1RS,4SR,9RS)、(2.16) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构对映体1R,4S,9R)、(2.17) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构对映体1S,4R,9S)、(2.18) 灭锈胺(meprotil)、(2.19) 氧化萎锈灵(oxycarboxin)、(2.20) 戊苯吡菌胺(penflufen)、(2.21) 吡噻菌胺(penthiopyrad)、(2.22) 氟唑环菌胺(sedaxane)、(2.23) 噻氟菌胺(thifluzamide)、(2.24) 1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.25) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.26) 3-(二氟甲基)-N-[4-氟-2-(1,1,2,3,3,3-六氟丙氧基)苯基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.27) N-[1-(2,4-二氯苯基)-1-甲氧基丙-2-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.28) 5,8-二氟-N-[2-(2-氟-4-{[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]氧基}苯基)乙基]喹唑啉-4-胺、(2.29) 苯并烯氟菌唑(benzovindiflupyr)、(2.30) N-[(1S,4R)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-桥亚甲基萘(methanonaphthalin)-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.31) N-[(1R,4S)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-桥亚甲基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.32) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.33) 1,3,5-三甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.34) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.35) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.36) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.37) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.38) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.39) 1,3,5-三甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.40) 1,3,5-三甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.41) 麦锈灵(benodanil)、(2.42) 2-氯-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)吡啶-3-甲酰胺、(2.43) isofetamid、(2.44) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[2'-(三氟甲基)联苯-2-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.45) N-(4'-氯联苯-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.46) N-(2',4'-二氯联苯-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.47) 3-

(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(三氟甲基)联苯-2-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.48) N-(2',5'-二氟联苯-2-基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.49) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.50) 5-氟-1,3-二甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.51) 2-氯-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)联苯-2-基]烟酰胺、(2.52) 3-(二氟甲基)-N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.53) N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.54) 3-(二氟甲基)-N-(4'-乙炔基联苯-2-基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.55) N-(4'-乙炔基联苯-2-基)-5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.56) 2-氯-N-(4'-乙炔基联苯-2-基)烟酰胺、(2.57) 2-氯-N-[4'-(3,3-二甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]烟酰胺、(2.58) 4-(二氟甲基)-2-甲基-N-[4'-(三氟甲基)联苯-2-基]-1,3-噻唑-5-羧酰胺、(2.59) 5-氟-N-[4'-(3-羟基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.60) 2-氯-N-[4'-(3-羟基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]烟酰胺、(2.61) 3-(二氟甲基)-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.62) 5-氟-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.63) 2-氯-N-[4'-(3-甲氧基-3-甲基丁-1-炔-1-基)联苯-2-基]烟酰胺、(2.64) 1,3-二甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.65) 1,3-二甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.66) 1,3-二甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.67) 3-(二氟甲基)-N-甲氧基-1-甲基-N-[1-(2,4,6-三氯苯基)丙-2-基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.68) 3-(二氟甲基)-N-(7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.69) 3-(二氟甲基)-N-[(3R)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.70) 3-(二氟甲基)-N-[(3S)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺。

[0890] 3) 呼吸链复合物III抑制剂,例如(3.01)唑啉菌胺(ametocetradin)、(3.02)吡啉磺菌胺(amisulbrom)、(3.03)噻菌酯(azoxystrobin)、(3.04)氰霜唑(cyazofamid)、(3.05)甲香菌酯(coumethoxystrobin)、(3.06)丁香菌酯(coumoxystrobin)、(3.07)醚菌胺(dimoxystrobin)、(3.08)enoxastrobin、(3.09)噁唑菌酮(famoxadon)、(3.10)咪唑菌酮(fenamidon)、(3.11)氟菌螨酯(flufenoxystrobin)、(3.12)氟噻菌酯(fluxastrobin)、(3.13)醚菌酯(kresoxim-methyl)、(3.14)苯氧菌胺(metominostrobin)、(3.15)肟醚菌胺(oryastrobin)、(3.16)啉氧菌酯(picoxystrobin)、(3.17)唑菌胺酯(pyraclostrobin)、(3.18)唑胺菌酯(pyrametostrobin)、(3.19)唑菌酯(pyraoxystrobin)、(3.20)吡菌苯威(pyribencarb)、(3.21)氯啉菌酯(triclopyricarb)、(3.22)肟菌酯(trifloxystrobin)、(3.23) (2E)-2-(2-{{6-(3-氯-2-甲基苯氧基)-5-氟嘧啶-4-基}氧基}苯基)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、(3.24) (2E)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-2-(2-{{((1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基}氨基)氧基}甲基}苯基)乙酰胺、(3.25) (2E)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-2-{2-[(E)-({1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基}亚氨基)甲基}苯基]乙酰胺、(3.26) (2E)-2-{2-[(E)-1-(3-{{(E)-1-氟-2-苯乙基}氧基}苯基)亚乙基]氨基}氧基}甲基}苯基}-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、(3.27) fenaminostrobin、(3.28) 5-甲氧基-2-甲基-4-(2-{{((1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基}氨基)氧基}甲基}苯基)-2,4-二

氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮、(3.29) (2E)-2-{2-[(环丙基[(4-甲氧基苯基)亚氨基]甲基]硫烷基)甲基]苯基}-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(3.30) N-(3-乙基-3,5,5-三甲基环己基)-3-甲酰胺基-2-羟基苯甲酰胺、(3.31) 2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺、(3.32) 2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺、(3.33) (2E,3Z)-5-{[1-(4-氯苯基)-1H-吡唑-3-基]氧基}-2-(甲氧基亚氨基)-N,3-二甲基五-3-烯酰胺。

[0891] 4) 有丝分裂和细胞分裂抑制剂,例如(4.01) 苯菌灵(benomyl)、(4.02) 多菌灵(carbendazim)、(4.03) 苯咪唑菌(chlorfenazole)、(4.04) 乙霉威(diethofencarb)、(4.05) 噻唑菌胺(ethaboxam)、(4.06) 氟啶酰菌胺(fluopicolide)、(4.07) 麦穗宁(fuberidazole)、(4.08) 戊菌隆(pencycuron)、(4.09) 噻菌灵(thiabendazole)、(4.10) 甲基硫菌灵(thiophanate-methyl)、(4.11) 硫菌灵(thiophanate)、(4.12) 苯酰菌胺(zoxamide)、(4.13) 5-氯-7-(4-甲基哌啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶、(4.14) 3-氯-5-(6-氯吡啶-3-基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)哒嗪。

[0892] 5) 具有多位点作用的化合物,例如(5.01) 波尔多混合液、(5.02) 敌菌丹(captafol)、(5.03) 克菌丹(captan)、(5.04) 百菌清(chlorothalonil)、(5.05) 氢氧化铜、(5.06) 环烷酸铜、(5.07) 氧化铜、(5.08) 氯氧化铜(copper oxychloride)、(5.09) 硫酸铜(2+)、(5.10) 抑菌灵(dichlofluanid)、(5.11) 二氰蒽醌(dithianon)、(5.12) 多果定(dodine)、(5.13) 多果定游离碱(dodine free base)、(5.14) 福美铁(ferbam)、(5.15) fluorofolpet、(5.16) 灭菌丹(folpet)、(5.17) 双胍辛盐(guazatine)、(5.18) 双胍辛乙酸盐(guazatine acetate)、(5.19) 双胍辛胺(iminoctadine)、(5.20) 双胍辛胺苯磺酸盐(iminoctadine albesilate)、(5.21) 双胍辛胺三乙酸盐(iminoctadine triacetate)、(5.22) 代森锰铜(mancopper)、(5.23) 代森锰锌(mancozeb)、(5.24) 代森锰(maneb)、(5.25) 代森联(metiram)、(5.26) 代森联锌(metiram zinc)、(5.27) 喹啉铜(oxine-copper)、(5.28) 丙烷脒(propamidine)、(5.29) 丙森锌(propineb)、(5.30) 包括多硫化钙(calcium polysulphide)的硫和硫制品、(5.31) 福美双(thiram)、(5.32) 甲苯氟磺胺(tolylfluanid)、(5.33) 代森锌(zineb)、(5.34) 福美锌(ziram)、(5.35) 敌菌灵(anilazine)。

[0893] 6) 能够诱导寄主防御的化合物,例如(6.01) 苯并噻二唑(acibenzolar-S-methyl)、(6.02) 异噻菌胺(isotianil)、(6.03) 烯丙苯噻唑(probenazole)、(6.04) 噻酰菌胺(tiadinil)、(6.05) 海带多糖(laminarin)。

[0894] 7) 氨基酸和/或蛋白质生物合成抑制剂,例如(7.01) andoprim、(7.02) 灭瘟素(blasticidin-S)、(7.03) 噻菌环胺(cyprodinil)、(7.04) 春雷霉素(kasug amycin)、(7.05) 春雷霉素盐酸盐水合物(kasug amycin hydrochloride hydrate)、(7.06) 噻菌胺(mepanipyrim)、(7.07) 噻霉胺(pyrimethanil)、(7.08) 3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉、(7.09) 氧四环素(oxytetracycline)、(7.10) 链霉素(streptomycin)。

[0895] 8) ATP产生抑制剂,例如(8.01) 三苯基乙酸锡(fentin acetate)、(8.02) 三苯基氯化锡(fentin chloride)、(8.03) 毒菌锡(fentin hydroxide)、(8.04) 硅噻菌胺(silthiofam)。

[0896] 9) 细胞壁合成抑制剂,例如(9.01) 苯噻菌胺(benthiavalicarb)、(9.02) 烯酰吗啉(dimethomorph)、(9.03) 氟吗啉(flumorph)、(9.04) 异丙菌胺(iprovalicarb)、(9.05) 双炔酰菌胺(mandipropamid)、(9.06) 多抗霉素(polyoxins)、(9.07) 多氧霉素(polyoxorim)、(9.08) 有效霉素A(validamycin A)、(9.09) 霜霉灭(valifenalate)、(9.10) 多氧菌素B(polyoxin B)、(9.11) (2E)-3-(4-叔丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(吗啉-4-基) 丙-2-烯-1-酮、(9.12) (2Z)-3-(4-叔丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(吗啉-4-基) 丙-2-烯-1-酮。

[0897] 10) 脂类和膜合成抑制剂,例如(10.01) 联苯、(10.02) 地茂散(chloroneb)、(10.03) 氯硝胺(dicloran)、(10.04) 敌瘟磷(edifenphos)、(10.05) 土菌灵(etridiazole)、(10.06) 碘代丙炔基丁基甲胺酸酯(iodocarb)、(10.07) 异稻瘟净(iprobenfos)、(10.08) 稻瘟灵(isoprothiolane)、(10.09) 霜霉威(propamocarb)、(10.10) 霜霉威盐酸盐(propamocarb hydrochloride)、(10.11) 胺丙威(prothiocarb)、(10.12) 吡菌磷(pyrazophos)、(10.13) 五氯硝基(quintozene)、(10.14) 四氯硝基苯(tecnazene)、(10.15) 甲基立枯磷(tolclofos-methyl)。

[0898] 11) 黑色素生物合成抑制剂,例如(11.01) 环丙酰菌胺(capropamid)、(11.02) 双氯氰菌胺(diclocymet)、(11.03) 氰菌胺(fenoxanil)、(11.04) 四氯苯酞(phthalide)、(11.05) 咯嗉酮(pyroquilon)、(11.06) 三环唑(tricyclazole)、(11.07) 2,2,2-三氟乙基{3-甲基-1-[(4-甲基苯甲酰基)氨基]丁-2-基}氨基甲酸酯。

[0899] 12) 核酸合成抑制剂,例如(12.01) 苯霜灵(benalaxyl)、(12.02) 精苯霜灵(benalaxyl-M)(kiralaxyl)、(12.03) 乙嘧酚磺酸酯(bupirimate)、(12.04) clozylacon、(12.05) 二甲嘧酚(dimethirimol)、(12.06) 乙嘧酚(ethirimol)、(12.07) 呋霜灵(furalaxyl)、(12.08) 噁霉灵(hymexazol)、(12.09) 甲霜灵(metalaxyl)、(12.10) 高效霜灵(精加霜灵)((metalaxyl-M)(mefenoxam))、(12.11) 呋酰胺(ofurace)、(12.12) 噁霜灵(oxadixyl)、(12.13) 噁喹酸(oxolinic acid)、(12.14) 辛噻酮(octhilinone)。

[0900] (13) 信号转导抑制剂,例如(13.01) 乙菌利(chlozolate)、(13.02) 拌种咯(fenpiclonil)、(13.03) 咯菌腈(fludioxonil)、(13.04) 异菌脲(iprodione)、(13.05) 腐霉利(procymidone)、(13.06) 苯氧喹啉(quinoxyfen)、(13.07) 乙烯菌核利(vinclozolin)、(13.08) 丙氧喹啉(proquinazid)。

[0901] 14) 能用作解偶联剂的化合物,例如(14.01) 乐杀螨(binapacryl)、(14.02) 敌螨普(dinocap)、(14.03) 嘧菌腈(ferimzone)、(14.04) 氟啶胺(fluzinam)、(14.05) 消螨多(meptyldinocap)。

[0902] 15) 其他化合物,例如(15.001) 苯噻硫氰(benthiazole)、(15.002) bethoxazin、(15.003) 卡巴西霉素(capsimycin)、(15.004) 香芹酮(carvone)、(15.005) 灭螨猛(quinomethionate)、(15.006) pyriofenone(氯芬酮(chlazafenone))、(15.007) 硫杂灵(cufraneb)、(15.008) 环氟菌胺(cyflufenamid)、(15.009) 霜脲氰(cymoxanil)、(15.010) 啉酰菌胺(cyprosulfamide)、(15.011) 棉隆(dazomet)、(15.012) 咪菌威(debacarb)、(15.013) 双氯酚(dichlorophen)、(15.014) 吡菌清(diclomezin)、(15.015) 野燕枯(difenzoquat)、(15.016) 野燕枯甲基硫酸酯(difenzoquat metilsulphate)、(15.017) 二苯胺(diphenylamine)、(15.018) Ecomate、(15.019) 胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)、

(15.020) 氟酰菌胺 (flumetover)、(15.021) 氟酰亚胺 (fluoroimide)、(15.022) 磺菌胺 (flusulphamide)、(15.023) flutianil、(15.024) 三乙膦酸铝 (fosetyl-aluminium)、(15.025) 三乙膦酸钙 (fosetyl-calcium)、(15.026) 三乙膦酸钠 (fosetyl-sodium)、(15.027) 六氯苯 (hexachlorobenzene)、(15.028) 人间霉素 (irumamycin)、(15.029) 磺菌威 (methasulphocarb)、(15.030) 异硫氰酸甲酯 (methyl isothiocyanate)、(15.031) 苯菌酮 (metrafenone)、(15.032) 米多霉素 (mildiomycin)、(15.033) 纳他霉素 (natamycin)、(15.034) 福美镍 (nickel dimethyldithiocarbamate)、(15.035) 酞菌酯 (nitrothal-isopropyl)、(15.036) oxamocarb、(15.037) oxyfenthin、(15.038) 五氯苯酚 (pentachlorophenol) 及其盐、(15.039) 苯醚菊酯 (phenothrin)、(15.040) 磷酸及其盐、(15.041) 霜霉威乙膦酸盐 (propamocarb-fosetyl-ate)、(15.042) propanosine-sodium、(15.043) 吡吗啉 (Pyrimorph)、(15.044) 吡咯尼群 (pyrrolnitrin)、(15.045) 异丁乙氧喹啉 (tebufloquin)、(15.046) 叶枯酞 (tecloftalam)、(15.047) tol-nifanid、(15.048) 咪唑啉 (triazoxide)、(15.049) 水杨菌胺 (trichlamid)、(15.050) 氰菌胺 (zarilamid)、(15.051) 2-甲基丙酸 (3S,6S,7R,8R)-8-苄基-3-[(3-[(异丁酰氧基)甲氧基]-4-甲氧基吡啶-2-基)羰基]氨基]-6-甲基-4,9-二氧化-1,5-二氧壬-7-基酯、(15.052) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}吡啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(15.053) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}吡啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(15.054) oxathiapiproline、(15.055) 1H-咪唑-1-羧酸 1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁-2-基酯、(15.056) 2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺酰基)吡啶、(15.057) 2,3-二丁基-6-氯噻吩并[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮、(15.058) 2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二噻英并[2,3-c:5,6-c']联吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮、(15.059) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[(5R)-5-苄基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}吡啶-1-基)乙酮、(15.060) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[(5S)-5-苄基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}吡啶-1-基)乙酮、(15.061) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[(5-苄基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基)-1,3-噻唑-2-基]吡啶-1-基}乙酮、(15.062) 2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4H-苯并吡喃-4-酮、(15.063) 2-氯-5-[2-氯-1-(2,6-二氟-4-甲氧基苯基)-4-甲基-1H-咪唑-5-基]吡啶、(15.064) 2-苄基苯酚和盐、(15.065) 3-(4,4,5-三氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉、(15.066) 3,4,5-三氯吡啶-2,6-二羧酸腈、(15.067) 3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基吡啶、(15.068) 4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基吡啶、(15.069) 5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇、(15.070) 5-氯-N'-苄基-N'-(丙-2-炔-1-基)噻吩-2-磺酰肼、(15.071) 5-氟-2-[4-氟苄基]嘧啶-4-胺、(15.072) 5-氟-2-[4-甲基苄基]嘧啶-4-胺、(15.073) 5-甲基-6-辛基[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-7-胺、(15.074) (2Z)-3-氨基-2-氰基-3-苯基丙烯酸乙酯、(15.075) N'-(4-{[3-(4-氯苄基)-1,2,4-噻二唑-5-基]氧基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.076) N-(4-氯苄基)-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]丙酰胺、(15.077) N-[4-氯苯基(氰基)甲基]-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]丙酰胺、(15.078) N-[5-溴-3-氯吡啶-2-基]甲基]-2,4-二氯烟酰胺、(15.079) N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯烟酰胺、(15.080) N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙

基]-2-氟-4-碘烟酰胺、(15.081) N-{(E)-[(环丙基甲氧基)亚氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苯基乙酰胺、(15.082) N-{(Z)-[(环丙基甲氧基)亚氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苯基乙酰胺、(15.083) N'-{4-[(3-叔丁基-4-氰基-1,2-噻唑-5-基)氧基]-2-氯-5-甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.084) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-(1,2,3,4-四氢萘-1-基)-1,3-噻唑-4-羧酰胺、(15.085) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-[(1R)-1,2,3,4-四氢萘-1-基]-1,3-噻唑-4-羧酰胺、(15.086) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-[(1S)-1,2,3,4-四氢萘-1-基]-1,3-噻唑-4-羧酰胺、(15.087) {6-[(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基}氧基]甲基]吡啶-2-基}氨基甲酸戊酯、(15.088) 吩嗪-1-羧酸、(15.089) 喹啉-8-醇、(15.090) 喹啉-8-醇硫酸酯(2:1)、(15.091) {6-[(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基}氧基]甲基]吡啶-2-基}氨基甲酸叔丁基酯、(15.092) (5-溴-2-甲氧基-4-甲基吡啶-3-基)(2,3,4-三甲氧基-6-甲基苯基)甲酮、(15.093) N-[2-(4-{[3-(4-氯苯基)丙-2-炔-1-基]氧基}-3-甲氧基苯基)乙基]-N2-(甲基磺酰基)缬氨酰胺、(15.094) 4-氧代-4-[(2-苯基乙基)氨基]丁酸、(15.095) {6-[(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基}氧基]甲基]吡啶-2-基}氨基甲酸丁-3-炔-1-基酯、(15.096) 4-氨基-5-氟嘧啶-2-醇(互变异构形式:4-氨基-5-氟嘧啶-2(1H)-酮)、(15.097) 3,4,5-三羟基苯甲酸丙酯、(15.098) [3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(15.099) (S)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(15.100) (R)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(15.101) 2-氟-6-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茚-4-基)苯甲酰胺、(15.102) 2-(6-苄基吡啶-2-基)喹啉、(15.103) 2-[6-(3-氟-4-甲氧基苯基)-5-甲基吡啶-2-基]喹啉、(15.104) 3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉、(15.105) 脱落酸、(15.106) N'-[5-溴-6-(2,3-二氢-1H-茚-2-基氧基)-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.107) N'-{5-溴-6-[1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.108) N'-{5-溴-6-[(1R)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.109) N'-{5-溴-6-[(1S)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.110) N'-{5-溴-6-[(顺式-4-异丙基环己基)氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.111) N'-{5-溴-6-[(反式-4-异丙基环己基)氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.112) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.113) N-环丙基-N-(2-环丙基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.114) N-(2-叔丁基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.115) N-(5-氯-2-乙基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.116) N-(5-氯-2-异丙基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.117) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-氟苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.118) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(5-氟-2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.119) N-环丙基-N-(2-环丙基-5-氟苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.120) N-(2-环戊基-5-氟苄基)-

N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.121) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-氟-6-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.122) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.123) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基-5-甲基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.124) N-环丙基-N-(2-环丙基-5-甲基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.125) N-(2-叔丁基-5-甲基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.126) N-[5-氯-2-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.127) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-N-[5-甲基-2-(三氟甲基)苄基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.128) N-[2-氯-6-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.129) N-[3-氯-2-氟-6-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.130) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-4,5-二甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(15.131) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-硫代甲酰胺、(15.132) N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基苄基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.133) N'-(4-[4,5-二氯-1,3-噻唑-2-基]氧基)-2,5-二甲基苄基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.134) N-(4-氯-2,6-二氟苄基)-4-(2-氯-4-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.135) 9-氟-2,2-二甲基-5-(喹啉-3-基)-2,3-二氢-1,4-苯并氧杂吡庚因、(15.136) 2-{2-氟-6-[(8-氟-2-甲基喹啉-3-基)氧基]苄基}丙-2-醇、(15.137) 2-{2-[(7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基)氧基]-6-氟苄基}丙-2-醇、(15.138) 4-(2-氯-4-氟苄基)-N-(2-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.139) 4-(2-氯-4-氟苄基)-N-(2,6-二氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.140) 4-(2-氯-4-氟苄基)-N-(2-氯-6-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.141) 4-(2-溴-4-氟苄基)-N-(2-氯-6-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.142) N-(2-溴-6-氟苄基)-4-(2-氯-4-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.143) 4-(2-溴-4-氟苄基)-N-(2-溴-6-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.144) 4-(2-溴-4-氟苄基)-N-(2-溴-6-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.145) 4-(2-溴-4-氟苄基)-N-(2-氯苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.146) N-(2-溴苄基)-4-(2-氯-4-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.147) 4-(2-氯-4-氟苄基)-N-(2-氯苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.148) 4-(2-溴-4-氟苄基)-N-(2,6-二氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.149) 4-(2-溴-4-氟苄基)-N-(2-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.150) N'-(4-{3-[(二氟甲氧基)硫烷基]苄氧基}-2,5-二甲基苄基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.151) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(1,1,2,2-四氟乙基)硫烷基]苄氧基}苄基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.152) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(2,2,2-三氟乙基)硫烷基]苄氧基}苄基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.153) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(2,2,3,3-四氟丙基)硫烷基]苄氧基}苄基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.154) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(五氟乙基)硫烷基]苄氧基}苄基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.155) N'-(4-{3-(二氟甲氧基)苄基}硫烷基)-2,5-二甲基苄基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.156) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(1,1,2,2-四氟乙氧基)苄基]硫烷基}苄基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.157) N'-(2,5-二甲基-4-{3-(2,2,2-三氟乙氧基)苄基}硫烷基}苄基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.158) N'-(2,5-二甲基-4-{3-(2,2,3,3-四氟丙氧基)苄基}硫烷基}苄基)-N-

乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.159) N'-(2,5-二甲基-4-[[3-(五氟乙氧基)苯基]硫烷基]苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.160) 2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.161) 2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.162) 2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.163) 2-{3-[2-(1-{[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基}苯基甲烷磺酸酯、(15.164) 2-{3-[2-(1-{[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基}-3-氯苯基甲烷磺酸酯、(15.165) 2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.166) 2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.167) 2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.168) 2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.169) 2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.170) 2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.171) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基}苯基甲烷磺酸酯、(15.172) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基}苯基甲烷磺酸酯、(15.173) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基}-3-氯苯基甲烷磺酸酯、(15.174) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基}-3-氯苯基甲烷磺酸酯。

[0903] 作为混合组分的生物农药

[0904] 式(I)的化合物可与生物农药结合。

[0905] 生物农药尤其包括细菌、真菌、酵母、植物提取物和由微生物形成的产物,包括蛋白质和次级代谢物。

[0906] 生物农药包括下列细菌:如形成孢子的细菌、根部定殖的细菌和用作生物杀昆虫剂、杀真菌剂或杀线虫剂的细菌。

[0907] 用作或可用作生物农药的这类细菌的实例为:

[0908] 解淀粉芽孢杆菌(*Bacillus amyloliquefaciens*),菌株FZB42(DSM 231179);或蜡样芽孢杆菌(*Bacillus cereus*),特别是蜡样芽孢杆菌菌株CNCM I-1562或坚强芽孢杆菌(*Bacillus firmus*);菌株I-1582(登录号CNCM I-1582)或短小芽孢杆菌(*Bacillus*

pumilus),特别是菌株GB34(登录号ATCC 700814)和菌株QST2808(登录号NRRL B-30087);或枯草芽孢杆菌(*Bacillus subtilis*),特别是菌株GB03(登录号ATCC SD-1397);或枯草芽孢杆菌菌株QST713(登录号NRRL B-21661)或枯草芽孢杆菌菌株OST30002(登录号NRRL B-50421);苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*),特别是苏云金芽孢杆菌以色列亚种(血清型H-14),菌株AM65-52(登录号ATCC 1276);或苏云金芽孢杆菌鲎泽亚种,特别是菌株ABTS-1857(SD-1372),或苏云金芽孢杆菌塔克亚种菌株HD-1,或苏云金芽孢杆菌tenebrionis亚种菌株NB 176(SD-5428);穿刺芽孢杆菌(*Pasteuria penetrans*);巴斯德氏芽菌属种(*Pasteuria* spp.) (肾形线虫(*Rotylenchulus reniformis* nematode))-PR3(登录号ATCC SD-5834);细黄链霉菌(*Streptomyces microflavus*)菌株AQ6121(=QRD 31.013,NRRL B-50550);鲜黄链霉菌(*Streptomyces galbus*)菌株AQ 6047(登录号NRRL 30232)。

[0909] 用作或可用作生物农药的真菌和酵母的实例是:

[0910] 球孢白僵菌(*Beauveria bassiana*),特别是菌株ATCC 74040;盾壳霉(*Coniothyrium minitans*),特别是菌株CON/M/91-8(登录号DSM-9660);蜡蚧菌属种(*Lecanicillium* spp.),特别是菌株HRO LEC 12;蜡蚧轮枝菌(*Lecanicillium lecanii*), (以前称为*Verticillium lecanii*),特别是菌株KV01;绿僵菌(*Metarhizium anisopliae*),特别是菌株F52(DSM3884/ATCC 90448);核果梅奇酵母(*Metschnikowia fructicola*),特别是菌株NRRL Y-30752;玫烟色拟青霉(*Paecilomyces fumosoroseus*) (现在为:*Isaria fumosorosea*),特别是菌株IFPC 200613或菌株Apopka 97(登录号ATCC 20874);淡紫色拟青霉(*Paecilomyces lilacinus*),特别是淡紫色拟青霉菌株251(AGAL 89/030550);黄色蠕形霉(*Talaromyces flavus*),特别是菌株V117b;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),特别是菌株SC1(登录号CBS 122089);哈茨木霉菌(*Trichoderma harzianum*),特别是哈茨木霉菌(*T.harzianum rifai*)T39.(登录号CNCM I-952)。

[0911] 用作或可用作生物农药的病毒的实例是:

[0912] 棉褐带卷蛾(*Adoxophyes orana*) (夏季水果卷叶蛾(summer fruit tortrix))微粒子病病毒(GV)、苹果蠹蛾(*Cydia pomonella*) (codling moth)微粒子病病毒(GV)、棉铃虫(*Helicoverpa armigera*) (cotton bollworm)核多角体病病毒(NPV)、甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua*) (beet armyworm)mNPV、草地贪夜蛾(*Spodoptera frugiperda*) (fall armyworm)mNPV、海灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis*) (African cotton leafworm)NPV。

[0913] 还包括这样的细菌和真菌:它们作为“接种物”加入植物或植物部位或植物器官,并且借助其特定性能促进植物生长和植物健康。实例包括:

[0914] 土壤杆菌属种(*Agrobacterium* spp.)、茎瘤固氮根瘤菌(*Azorhizobium caulinodans*)、固氮螺菌属种(*Azospirillum* spp.)、固氮菌属种(*Azotobacter* spp.)、慢生根瘤菌属种(*Bradyrhizobium* spp.)、伯克氏菌属种(*Burkholderia* spp.) (尤其是洋葱伯克霍尔德菌(*Burkholderia cepacia*) (以前称为洋葱假单胞菌(*Pseudomonas cepacia*)))、巨孢囊霉属种(*Gigaspora* spp.)或单孢巨孢囊霉(*Gigaspora monosporum*)、球囊霉属种(*Glomus* spp.)、蜡蘑属种(*Laccaria* spp.)、布氏乳杆菌(*Lactobacillus buchneri*)、类球囊霉属种(*Paraglomus* spp.)、*Pisolithus tinctorius*、假单胞菌属种(*Pseudomonas* spp.)、根瘤菌属种(*Rhizobium* spp.) (尤其是车轴草根瘤菌(*Rhizobium*

trifolii))、须腹菌属种(Rhizopogon spp.)、硬马勃菌属种(Scleroderma spp.)、乳牛肝菌属种(Suillus spp.)、链霉菌属种(Streptomyces spp.)。

[0915] 用作或可用作生物农药的植物提取物和由微生物形成的产物——包括蛋白质和次级代谢物——的实例是：

[0916] 大蒜(*Allium sativum*)、苦艾(*Artemisia absinthium*)、印楝素(azadirachtin)、Biokeeper WP、*Cassia nigricans*、苦皮藤(*Celastrus angulatus*)、*Chenopodium anthelminticum*、几丁质、Armour-Zen、欧洲鳞毛蕨(*Dryopteris filix-mas*)、问荆(*Equisetum arvense*)、Fortune Aza、Fungastop、Heads Up(藜麦皂素(*Chenopodium quinoa* saponin)提取物)、除虫菊/除虫菊素(pyrethrum/Pyrethrins)、苏里南苦木(*Quassia amara*)、栎树(*Quercus*)、皂树(*Quillaja*)、Regalia、“RequiemTM杀昆虫剂”、鱼藤酮(rotenone)、鱼泥汀(ryania)/兰尼碱(ryania)、聚合草(*Symphytum officinale*)、菊蒿(*Tanacetum vulgare*)、麝香草酚(thymol)、Triact70、TriCon、*Tropaeolum majus*、大荨麻(*Urtica dioica*)、藜芦碱(Veratrin)、白槲寄生(*Viscum album*)、十字花科(Brassicaceae)提取物,尤其是油菜粉或芥末粉。

[0917] 作为混合组分的安全剂

[0918] 式(I)的化合物可与安全剂结合,所述安全剂为例如解草啉(benoxacor)、解草酯(cloquintocet(-mexyl))、解草胺腈(cyometrinil)、啉酰菌胺(cyprosulphamide)、二氯丙烯胺(dichlormid)、解草唑(fenchlorazole(-ethyl))、解草啉(fenclorim)、解草胺(flurazole)、氟草肟(fluxofenim)、解草噁唑(furilazole)、双苯噁唑酸(isoxadifen(-ethyl))、吡啶解草酯(mefenpyr(-diethyl))、萘二甲酸酐(naphthalicanhydride)、解草腈(oxabetrinil)、2-甲氧基-N-({4-[(甲基氨基甲酰基) 氨基] 苯基} 磺酰基) 苯甲酰胺(CAS 129531-12-0)、4-(二氯乙酰基)-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷(CAS 71526-07-3)、2,2,5-三甲基-3-(二氯乙酰基)-1,3-噁唑烷(CAS 52836-31-4)。

[0919] 植物和植物部位

[0920] 所有的植物和植物部位均可根据本发明进行处理。在本文中,植物应理解为意指所有的植物和植物种群,例如期望和不期望的野生植物或作物植物(包括天然存在的作物植物),例如谷物(小麦、稻、黑小麦、大麦、黑麦、燕麦)、玉米、大豆、马铃薯、甜菜、甘蔗、番茄、甜椒和辣椒、黄瓜、甜瓜、胡萝卜、西瓜、洋葱、莴苣、菠菜、韭菜、豆类、甘蓝(例如卷心菜)、豌豆和其他蔬菜品种、棉花、烟草、油菜以及结果植物(果实为苹果、梨、柑橘类果实和葡萄)。作物植物可为通过常规育种及优化方法或通过生物技术和基因工程方法或这些方法的组合获得的植物,包括转基因植物且包括可受和不受植物育种者权利保护的植物栽培种。植物应理解为意指植物的所有发育阶段,例如种子、插条和幼年(未成熟的)植物直到成熟植物。植物部位应理解为意指植物的地上和地下的所有部位和器官,如芽、叶、花及根,实例为叶、针叶、茎、干、花、子实体、果实和种子,以及根、块茎及根茎。植物部位还包括采收的材料(采收的植物或植物部位)以及无性和有性繁殖材料,例如插条、块茎、根茎、幼枝(slip)和种子。

[0921] 本发明的用式(I)的化合物对植物和植物部位进行的处理通过常规处理方法直接进行或使所述化合物作用于其环境、生境或储存空间而进行,所述常规处理方法为例如浸渍、喷雾、蒸发、弥雾(fogging)、散布(scattering)、涂布、注射,并且在繁殖材料的情况下、

尤其是在种子的情况下,还通过施加一层或多层包衣来进行。

[0922] 如上所述,可以根据本发明处理所有的植物及其部位。在一个优选的实施方案中,处理野生植物品种和植物栽培种或那些通过常规生物培育方法例如杂交或原生质体融合而获得的植物及其部位。在另一个优选的实施方案中,处理通过基因工程方法——如果合适与常规方法(遗传修饰生物体)相结合——获得的转基因植物和植物栽培种及其部位。术语“部位”或“植物的部位”或“植物部位”已在上文作出解释。根据本发明特别优选处理相应的市售的常规植物栽培种的植物或正在使用的那些植物。植物栽培种应理解为意指具有新特性(“性状”)并且已通过常规育种、通过突变或通过重组DNA技术生长的植物。它们可以是栽培种、变种、生物型或基因型。

[0923] 转基因植物、种子处理和整合株系(integration event)

[0924] 根据本发明处理的优选的转基因植物或植物栽培种(通过基因工程获得的那些)包括通过遗传修饰而接受了将特别有利的有用特性(“性状”)赋予这些植物的遗传物质的所有植物。这些特性的实例是更好的植物生长、对高温或低温的耐受性提高、对干旱或对水或土壤盐度水平的耐受性提高、增强的开花性能、更容易采收、加速成熟、更高的采收产量、采收产物的更高的品质和/或更高的营养价值、采收产物能够更好的贮存和/或加工。这些特性的其他且特别强调的实例是,植物对动物和微生物害虫如昆虫、蛛形纲动物、线虫、螨、蛞蝓和腹足类动物的抗性提高,这是由于例如在植物中形成的毒素,特别是通过来自苏云金芽孢杆菌的遗传物质(例如通过基因CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb和CryIF及其组合)在植物中形成的那些毒素;以及植物对植物病原性真菌、细菌和/或病毒(例如由系统获得性抗性(SAR)、系统素、植物抗毒素、诱导子和抗性基因以及相应表达的蛋白和毒素而引起的)的抗性提高;以及植物对某些除草活性化合物(例如咪唑啉酮类、磺脲类、草甘膦或草丁膦(例如“PAT”基因))的耐受性增加。赋予所述期望特性(“性状”)的基因还可以在转基因植物中以相互结合的方式存在。转基因植物的实例包括重要的作物植物,例如谷物(小麦、稻、黑小麦、大麦、黑麦、燕麦)、玉米、大豆、马铃薯、甜菜、甘蔗、番茄、豌豆和其他类型的蔬菜、棉花、烟草、油菜以及结果植物(结有果实苹果、梨、柑橘类果实和葡萄),特别强调的是玉米、大豆、小麦、稻、马铃薯、棉花、甘蔗、烟草和油菜。特别强调的特性(“性状”)是植物对昆虫、蛛形纲动物、线虫和蛞蝓及腹足类动物的抗性提高。

[0925] 作物保护——处理的类型

[0926] 通过使用常规处理方法使用式(I)的化合物对植物和植物部位直接处理或通过作用于其环境、生境或储存空间来处理,所述常规处理方法例如浸渍、喷雾、雾化、灌溉、蒸发、撒粉、弥雾、撒播、发泡、涂布、铺展(spreading-on)、注射、浇水(浸透)、滴灌,并且在繁殖材料的情况下、特别是在种子的情况下,还通过干燥种子处理、液体种子处理、浆料处理,通过形成包壳(incrusting),通过用一层或多层包衣包覆等。还可通过超低容量法施用式(I)的化合物,或将所述施用形式或式(I)的化合物本身注入土壤中。

[0927] 优选的对植物的直接处理为叶面施用,即将式(I)的化合物施用至叶子,其中应根据所述害虫的侵染水平来调节处理频率和施用率。

[0928] 在内吸收的活性化合物的情况下,式(I)的化合物还通过根系进入植物。然后,通过使式(I)的化合物作用于植物的生境来处理植物。这可以例如通过以下方式来完成:浸透

或混入土壤或营养液中,意指用式(I)的化合物的液体形式浸渍植物的位置(例如土壤或水培体系);或土壤施用,意指将式(I)的化合物以固体形式(例如以颗粒剂的形式)引入植物的位置。在水稻作物的情况下,这还可通过将式(I)的化合物以固体施用的形式(例如以颗粒剂的形式)计量加入淹没的(flooded)水稻田中来完成。

[0929] 种子处理

[0930] 通过处理植物的种子来防治动物害虫是早就已知的,并且是不断改进的主题。然而,种子处理涉及一系列始终无法以令人满意的方式解决的问题。因此,期望开发保护种子和发芽植物的方法,所述方法在储存过程中、在播种后或在植物出苗后无需、或至少显著地减少额外的农药施用。此外,期望优化活性成分的用量,从而为种子和发芽植物提供最佳保护,使其免受动物害虫的侵袭,而所使用的活性成分不会损害植物本身。特别地,为了使用最少的农药消耗实现对种子和发芽植物的最佳保护,处理种子的方法还应考虑害虫抗性 or 害虫耐受性的转基因植物所固有的杀昆虫或杀线虫特性。

[0931] 因此,本发明还特别涉及一种通过用式(I)的化合物之一处理种子来保护种子和发芽植物免受害虫侵袭的方法。本发明的保护种子和发芽植物免受害虫侵袭的方法还包括其中在一次操作中同时或依序用式(I)的化合物和混合组分处理种子的方法。其还包括其中在不同时间用式(I)的化合物和混合组分处理种子的方法。

[0932] 本发明还涉及式(I)的化合物用于处理种子以保护种子和所得植物免受动物害虫侵袭的用途。

[0933] 本发明还涉及已用式(I)的化合物处理以免受动物害虫侵袭的种子。本发明还涉及已同时用式(I)的化合物和混合组分处理的种子。本发明还涉及已在不同时间用式(I)的化合物和混合组分处理的种子。在已在不同时间用式(I)的化合物和混合组分处理种子的情况下,各物质可以不同的层存在于种子上。在此情况下,包含式(I)的化合物和混合组分的层可任选地被中间层隔开。本发明还涉及这样的种子:其中式(I)的化合物和混合组分作为包衣的一部分或作为除包衣之外的另一层或另几层而被施用。

[0934] 本发明还涉及这样的种子:在用式(I)的化合物处理之后,对其进行薄膜涂覆过程以防止灰尘对种子的磨损。

[0935] 具有内吸收作用的式(I)的化合物的优点之一在于以下事实:通过处理种子,不仅保护种子本身还保护由其得到的植物在出苗后免受动物害虫的侵袭。以这种方式,可无需在播种时或在播种后不久对作物进行即时处理。

[0936] 另一优点在于,用式(I)的化合物处理种子可促进经处理的种子的发芽和出苗。

[0937] 同样认为有利的是,式(I)的化合物还可尤其用于转基因种子。

[0938] 此外,式(I)的化合物可与信号技术组合物结合使用,从而使得通过共生体(例如根瘤菌、菌根和/或植物内生细菌或真菌)而更好地定殖和/或优化固氮作用。

[0939] 式(I)的化合物适合于保护在农业、温室、林业或园艺中使用的任何植物品种的种子。更特别地,这包括下述植物的种子:谷物(例如小麦、大麦、黑麦、粟和燕麦)、玉米、棉花、大豆、稻、马铃薯、向日葵、咖啡、烟草、加拿大油菜(canola)、油菜、甜菜(例如糖用甜菜和饲用甜菜)、花生、蔬菜(例如番茄、黄瓜、豆类、十字花科蔬菜、洋葱和莴苣)、结果植物、草坪和观赏植物。特别重要的是处理谷物(如小麦、大麦、黑麦和燕麦)、玉米、大豆、棉花、加拿大油菜、油菜和稻的种子。

[0940] 如上所述,用式(I)的化合物处理转基因种子也是特别重要的。这涉及通常含有至少一种异源基因的植物的种子,所述异源基因控制特别是具有杀昆虫和/或杀线虫特性的多肽的表达。在此情况下,转基因种子中的异源基因可源自下列微生物:如芽孢杆菌属(*Bacillus*)、根瘤菌属(*Rhizobium*)、假单孢菌属(*Pseudomonas*)、沙雷氏菌属(*Serratia*)、木霉菌(*Trichoderma*)、棒形杆菌(*Clavibacter*)、球囊霉(*Glomus*)或粘帚霉(*Gliocladium*)。本发明特别适于处理含有至少一种源自芽孢杆菌属种(*Bacillus* sp)的异源基因的转基因种子。所述异源基因更优选源自苏云金芽孢杆菌。

[0941] 在本发明的上下文中,将式(I)的化合物施用于种子。优选在这样的状态下处理种子:其足够稳定以使得在处理过程中不发生损害。通常,可在采收和播种之间的任何时间处理种子。通常使用已从植物中分离并且已除去穗轴、壳、茎、荚、毛或果肉的种子。例如,可以使用已采收、清理且干燥至允许储存的含水量的种子。或者,还可以使用在干燥后用例如水处理然后再干燥(例如灌注(priming))的种子。在稻的种子的情况下,还可以使用例如已在水中预先溶胀至特定阶段(种子凸出(pigeon breast)阶段)的种子,这改善了发芽情况并使出苗更均匀。

[0942] 当处理种子时,通常必须注意选择施用于种子的式(I)的化合物的量和/或其他添加剂的量,以使种子的发芽不受到不利影响或所得植物不受到损害。对于在特定施用率下可表现出植物毒性作用的活性化合物,必须特别确保这一点。

[0943] 通常,将式(I)的化合物以合适的制剂形式施用至种子。合适的用于种子处理的制剂和方法对于本领域技术人员是已知的。

[0944] 可将式(I)的化合物转化成常规的拌种制剂,如溶液剂、乳剂、悬浮剂、粉剂、泡沫剂、浆剂或其他种子包衣组合物,以及ULV制剂。

[0945] 这些制剂以已知方式通过将式(I)的化合物与常规添加剂混合而制备,所述常规添加剂例如常规增量剂以及溶剂或稀释剂、染料、润湿剂、分散剂、乳化剂、消泡剂、防腐剂、二次增稠剂、粘合剂、赤霉素以及水。

[0946] 可存在于根据本发明可用的拌种制剂中的染料为通常用于此目的的所有染料。可以使用微溶于水的颜料或溶于水的染料。实例包括已知名称为罗丹明B、C.I. 颜料红112和C.I. 溶剂红1的染料。

[0947] 可存在于根据本发明可用的拌种制剂中的有用的润湿剂为促进润湿且通常用于配制活性农用化学成分的所有物质。可优选使用烷基萘磺酸盐,如萘磺酸二异丙酯或萘磺酸二异丁酯。

[0948] 可存在于根据本发明可用的拌种制剂中的合适的分散剂和/或乳化剂为通常用于配制活性农用化学成分的所有非离子、阴离子和阳离子分散剂。可优选使用非离子或阴离子分散剂,或非离子或阴离子分散剂的混合物。合适的非离子分散剂特别包括环氧乙烷/环氧丙烷嵌段聚合物、烷基酚聚乙二醇醚和三苯乙基酚聚乙二醇醚,及其磷酸化或硫酸化衍生物。合适的阴离子分散剂尤其为木素磺酸盐、聚丙烯酸盐和芳基磺酸盐-甲醛缩合物。

[0949] 可存在于根据本发明可用的拌种制剂中的消泡剂为通常用于配制活性农用化学成分的所有抑制泡沫的物质。可优选使用硅酮消泡剂和硬脂酸镁。

[0950] 可存在于根据本发明可用的拌种制剂中的防腐剂为在农用化学组合物中可用于此目的的所有物质。实例包括双氯酚和苄醇半缩甲醛。

[0951] 可存在于根据本发明可用的拌种制剂中的二次增稠剂为在农用化学组合物中可用于此目的的所有物质。优选的实例包括纤维素衍生物、丙烯酸衍生物、黄原胶、改性粘土以及细分散的二氧化硅。

[0952] 可存在于根据本发明可用的拌种制剂中的有用的粘着剂为可用于拌种产品中的所有常规粘结剂。优选的实例包括聚乙烯吡咯烷酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇和纤基乙酸钠(tylose)。

[0953] 可存在于根据本发明可用的拌种制剂中的赤霉素优选为赤霉素A1、A3(=赤霉酸)、A4和A7;特别优选使用赤霉酸。赤霉素为已知的(参见R.Wegler“Chemie der Pflanzenschutz-und **Schädlingsbekämpfungsmittel**”,第2卷,Springer Verlag,1970,第401-412页)。

[0954] 根据本发明可用的拌种制剂可直接或预先用水稀释后用于处理各种不同种类的种子。例如,浓缩剂或可通过用水稀释而由其获得的制剂可用于拌种以下植物的种子:谷物(如小麦、大麦、黑麦、燕麦和黑小麦)的种子,以及玉米、稻、油菜、豌豆、豆类、棉花、向日葵、大豆和甜菜的种子,或各种不同的蔬菜种子。根据本发明可用的拌种制剂或其稀释的使用形式还可用于对转基因植物的种子进行拌种。

[0955] 对于用根据本发明可用的拌种制剂或由其制备的使用形式处理种子而言,所有可常规用于拌种的混合装置都是有用的。具体而言,拌种的过程为:将种子以分批或连续操作的方式置于混合器内;加入特定所需量的拌种制剂(以其本身或预先用水稀释后);并混合直至制剂均匀地分布在种子上。如果合适,随后进行干燥操作。

[0956] 根据本发明可用的拌种制剂的施用率可在相对宽的范围内变化。其由制剂中式(I)的化合物的具体含量和种子决定。式(I)的化合物的施用率通常为每千克种子0.001至50g,优选每千克种子0.01至15g。

[0957] 动物健康

[0958] 在动物健康领域,即在兽医学领域,式(I)的化合物对于动物寄生虫、特别是体外寄生虫或体内寄生虫具有活性。术语“体内寄生虫”尤其包括蠕虫和原生动物,如球虫(coccidia)。体外寄生虫通常且优选为节肢动物,尤其是昆虫和螨。

[0959] 在兽医学领域,具有有利的温血动物毒性的式(I)的化合物适合于防治在家畜、育种动物、动物园动物、实验室动物、实验动物和家养动物的动物育种和动物饲养中出现的寄生虫。它们对寄生虫的所有或特定发育阶段具有活性。

[0960] 农业家畜包括,例如,哺乳动物,如绵羊、山羊、马、驴、骆驼、水牛、兔、驯鹿、小鹿,且特别是牛和猪;家禽,如火鸡、鸭、鹅,且特别是鸡;例如在水产养殖中的鱼和甲壳类动物;以及昆虫,如蜜蜂。

[0961] 家养动物包括,例如,哺乳动物,如仓鼠、豚鼠、大鼠、小鼠、毛丝鼠、雪貂,且特别是狗、猫、笼养鸟、爬行动物、两栖动物和观赏鱼。

[0962] 在一个优选的实施方案中,将式(I)的化合物施用于哺乳动物。

[0963] 在另一个优选的实施方案中,将式(I)的化合物施用于鸟类,即笼养鸟,且特别是家禽。

[0964] 使用式(I)的化合物来防治动物寄生虫旨在减少或预防疾病、死亡病例和性能下降(在肉、奶、羊毛、皮、蛋、蜜等的情况下),从而使得动物饲养更经济和更简单,并可实现更

好的动物健康。

[0965] 关于动物健康领域,术语“防治(control)”或“防治(controlling)”意指式(I)的化合物有效地将特定寄生虫在被这类寄生虫感染的动物中的发病率降低至无害的程度。更特别地,本文中的“防治”意指式(I)的化合物可杀死各种寄生虫、抑制其生长或抑制其繁殖。

[0966] 节肢动物包括:

[0967] 虱目(Anoplurida)的节肢动物,例如,血虱属种(*Haematopinus* spp.)、毛虱属种(*Linognathus* spp.)、虱属种(*Pediculus* spp.)、阴虱属种(*Phthirus* spp.)、管虱属种(*Solenopotes* spp.);食毛目(Mallophagida)和钝角亚目(Amblycerina)和细角亚目(Ischnocerina)的节肢动物,例如毛羽虱属种(*Trimenopon* spp.)、禽虱属种(*Menopon* spp.)、鸭虱属种(*Trinoton* spp.)、牛羽虱属种(*Bovicola* spp.)、*Werneckiella*属种、*Lepikentron*属种、畜虱属种(*Damalina* spp.)、啮毛虱属种(*Trichodectes* spp.)、猫羽虱属种(*Felicola* spp.);来自双翅目(Diptera)和长角亚目(Nematocerina)和短角亚目(Brachycerina)的节肢动物,例如伊蚊属种(*Aedes* spp.)、按蚊属种(*Anopheles* spp.)、库蚊属种(*Culex* spp.)、蚋属种(*Simulium* spp.)、真蚋属种(*Eusimulium* spp.)、白蛉属种(*Phlebotomus* spp.)、罗蛉属种(*Lutzomyia* spp.)、库蠓属种(*Culicoides* spp.)、斑虻属种(*Chrysops* spp.)、短蚋亚属种(*Odagmia* spp.)、维蚋属种(*Wilhelmia* spp.)、瘤虻属种(*Hybomitra* spp.)、黄虻属种(*Atylotus* spp.)、虻属种(*Tabanus* spp.)、麻虻属种(*Haematopota* spp.)、*Philipomyia*属种、蜂虱蝇属种(*Braula* spp.)、蝇属种(*Musca* spp.)、齿股蝇属种(*Hydrotaea* spp.)、螫蝇属种(*Stomoxys* spp.)、血蝇属种(*Haematobia* spp.)、*Morellia*属种、厕蝇属种(*Fannia* spp.)、舌蝇属种(*Glossina* spp.)、丽蝇属种(*Calliphora* spp.)、绿蝇属种(*Lucilia* spp.)、金蝇属种(*Chrysomyia* spp.)、污蝇属种(*Wohlfahrtia* spp.)、麻蝇属种(*Sarcophaga* spp.)、*Oestrus*属种、皮蝇属种(*Hypoderma* spp.)、胃蝇属种(*Gasterophilus* spp.)、虱蝇属种(*Hippobosca* spp.)、*Lipoptena*属种、蜚蝇属种(*Melophagus* spp.)、鼻狂蝇属种(*Rhinoestrus* spp.)、大蚊属种(*Tipula* spp.);蚤目(Siphonapterida)的节肢动物,例如蚤属种(*Pulex* spp.)、栉首蚤属种(*Ctenocephalides* spp.)、潜蚤属种(*Tunga* spp.)、客蚤属种(*Xenopsylla* spp.)、角叶蚤属种(*Ceratophyllus* spp.);

[0968] 异翅目(Heteropterida)的节肢动物,例如,臭虫属种(*Cimex* spp.)、锥猎蝽属种(*Triatoma* spp.)、红猎蝽属种(*Rhodnius* spp.)、锥蝽属种(*Panstrongylus* spp.);以及蜚蠊目的令人生厌的害虫和卫生害虫。

[0969] 节肢动物还包括:

[0970] 蜱螨亚纲(Acari)(蜱螨目(Acarina))和后气门目(Metastigmata)的节肢动物,例如隐喙蜱科(Argasidae)如锐缘蜱属种(*Argas* spp.)、钝缘蜱属种(*Ornithodoros* spp.)、耳疥癣虫属种(*Otobius* spp.)、硬蜱科(Ixodidae)如硬蜱属种(*Ixodes* spp.)、花蜱属种(*Amblyomma* spp.)、扇头蜱属种(*Rhipicephalus* (牛蜱属种(*Boophilus*)) spp.)、革蜱属种(*Dermacentor* spp.)、*Haemophysalis*属种、璃眼蜱属种(*Hyalomma* spp.)、扇头蜱属种(*Rhipicephalus* spp.) (多宿主蜱虫的原始属种);中气门目(Mesostigmata)的节肢动物如皮刺螨属种(*Dermanyssus* spp.)、禽刺螨属种(*Ornithonyssus* spp.)、*Pneumonyssus*属种、

刺利螨属种 (*Raillietia* spp.)、肺刺螨属种 (*Pneumonyssus* spp.)、胸刺螨属种 (*Sternostoma* spp.)、瓦螨属种 (*Varroa* spp.)、蜂盾螨属种 (*Acarapis* spp.)；辐螨目 (*Actinedida*) (前气门目 (*Prostigmata*)) 的节肢动物, 例如蜂盾螨属种 (*Acarapis* spp.)、姬螯螨属种 (*Cheyletiella* spp.)、禽螯螨属种 (*Ornithocheyletia* spp.)、肉螨属种 (*Myobia* spp.)、疮螨属种 (*Psorergates* spp.)、蠕形螨属种 (*Demodex* spp.)、恙螨属种 (*Trombicula* spp.)、*Neotrombicula* 属种、*Listrophorus* 属种; 粉螨目 (*Acaridida*) (无气门目 (*Astigmata*)) 的节肢动物, 例如粉螨属种 (*Acarus* spp.)、食酪螨属种 (*Tyrophagus* spp.)、嗜木螨属种 (*Caloglyphus* spp.)、颈下螨属种 (*Hypodectes* spp.)、翅螨属种 (*Pterolichus* spp.)、痒螨属种 (*Psoroptes* spp.)、足螨属种 (*Chorioptes* spp.)、耳螨属种 (*Otodectes* spp.)、疥螨属种 (*Sarcoptes* spp.)、背肛螨属种 (*Notoedres* spp.)、疙螨属种 (*Knemidocoptes* spp.)、胞螨属种 (*Cytodites* spp.)、鸡雏螨属种 (*Laminosioptes* spp.)。

[0971] 寄生性原生动物包括:

[0972] 鞭毛纲 (*Mastigophora* (*Flagellata*)), 例如, 锥虫科 (*Trypanosomatidae*), 例如, 布鲁斯锥虫 (*Trypanosoma b. brucei*)、冈比锥虫 (*T. b. gambiense*)、罗德森锥虫 (*T. b. rhodesiense*)、刚果锥虫 (*T. congolense*)、克鲁兹锥虫 (*T. cruzi*)、伊氏锥虫 (*T. evansi*)、马锥虫 (*T. equinum*)、刘氏锥虫 (*T. lewisi*)、鲈鱼锥虫 (*T. percae*)、猿猴锥虫 (*T. simiae*)、活跃锥虫 (*T. vivax*)、巴西利什曼虫 (*Leishmania brasiliensis*)、多氏利什曼虫 (*L. donovani*)、热带利什曼虫 (*L. tropica*), 例如毛滴虫科 (*Trichomonadidae*), 例如兰氏贾第虫 (*Giardia lamblia*)、犬贾第虫 (*G. canis*);

[0973] 肉鞭毛虫亚门 (*Sarcomastigophora*) (根足虫纲 (*Rhizopoda*)), 例如内阿米巴科 (*Entamoebidae*), 例如痢疾内阿米巴 (*Entamoeba histolytica*); 哈氏虫科 (*Hartmanellidae*), 例如棘变形虫属种 (*Acanthamoeba* sp.)、哈氏虫属种 (*Harmanella* sp.);

[0974] 顶复亚门 (*Apicomplexa*) (孢子纲 (*Sporozoa*)), 例如艾美虫科 (*Eimeridae*), 例如堆形艾美虫 (*Eimeria acervulina*)、腺样艾美虫 (*E. adenoides*)、阿州艾美虫 (*E. alabamensis*)、鸭艾美虫 (*E. anatis*)、鹅艾美虫 (*E. anserina*)、阿氏艾美虫 (*E. arloingi*)、阿洛尼氏艾美虫 (*E. ashata*)、奥本艾美虫 (*E. auburnensis*)、牛艾美虫 (*E. bovis*)、波氏艾美虫 (*E. brunetti*)、犬艾美虫 (*E. canis*)、美栗鼠艾美虫 (*E. chinchillae*)、*E. clupearum*、鸽艾美虫 (*E. columbae*)、*E. contorta*、槌状艾美虫 (*E. crandalis*)、德氏艾美虫 (*E. debliecki*)、散布艾美虫 (*E. dispersa*)、椭圆艾美虫 (*E. ellipsoidales*)、镰刀形艾美虫 (*E. falciformis*)、福氏艾美虫 (*E. faurei*)、黄色艾美虫 (*E. flavescens*)、加洛帕沃尼艾美虫 (*E. gallopavonis*)、哈氏艾美虫 (*E. hagani*)、肠艾美虫 (*E. intestinalis*)、*E. iroquoina*、无残艾美虫 (*E. irresidua*)、唇艾美虫 (*E. labbeana*)、勒氏艾美虫 (*E. leucarti*)、大型艾美虫 (*E. magna*)、巨型艾美虫 (*E. maxima*)、中型艾美虫 (*E. media*)、珠鸡艾美虫 (*E. meleagridis*)、火鸡和缓艾美虫 (*E. meleagritidis*)、和缓艾美虫 (*E. mitis*)、毒害艾美虫 (*E. necatrix*)、雅氏艾美虫 (*E. ninakohlyakimovae*)、羊艾美虫 (*E. ovis*)、小型艾美虫 (*E. parva*)、孔雀艾美虫 (*E. pavonis*)、穿孔艾美虫 (*E. perforans*)、*E. phasani*、梨形艾美虫 (*E. piriformis*)、早熟艾美虫 (*E. praecox*)、*E. residua*、粗糙艾美虫

(*E. scabra*)、*E. spec.*、斯氏艾美虫(*E. stiedai*)、猪艾美虫(*E. suis*)、禽艾美虫(*E. tenella*)、树艾美虫(*E. truncata*)、特鲁特艾美虫(*E. truttae*)、邱氏艾美虫(*E. zuernii*)；格洛虫属种(*Globidium spec.*)，贝氏等孢子虫(*Isospora belli*)、犬等孢子虫(*I. canis*)、猫等孢子虫(*I. felis*)、俄亥俄等孢子虫(*I. ohioensis*)、*I. rivolta*、等孢子虫属种(*I. spec.*)、猪等孢子虫(*I. suis*)、*Cystisospora*属种、隐抱属种(*Cryptosporidium spec.*)，特别是*C. parvum*；例如弓形虫科(*Toxoplasmodidae*)，例如鼠弓形虫(*Toxoplasma gondii*)、*Hammondia heydornii*、*Neospora caninum*、贝斯虫(*Besnoitia besnoitii*)；例如肉孢子虫科(*Sarcocystidae*)，例如牛犬肉孢子虫(*Sarcocystis bovicanis*)、牛人肉孢子虫(*S. bovi hominis*)、羊犬肉孢子虫(*S. ovicanis*)、羊猫肉孢子虫(*S. ovifelis*)、*S. neurona*、肉孢子虫属种(*S. spec.*)、猪人肉孢子虫(*S. sui hominis*) 例如 *Leucozoidae* 例如 *Leucozytozoon simondi*，例如症原虫科(*Plasmodiidae*)，例如伯氏鼠症原虫(*Plasmodium berghei*)、镰状症原虫(*P. falciparum*)、三日症原虫(*P. malariae*)、卵形症原虫(*P. ovale*)、间日症原虫(*P. vivax*)，症原虫属种(*P. spec.*)，例如焦虫纲(*Piroplasma*)，例如阿根廷巴贝虫(*Babesia argentina*)、牛巴贝虫(*B. bovis*)、犬巴贝虫(*B. canis*)、巴贝虫属种(*B. spec.*)、泰勒原虫(*Theileria parva*)，泰勒虫属种(*Theileria spec.*)，例如匿虫亚目(*Adeleina*)，例如犬肝簇虫(*Hepatozoon canis*)、肝簇虫属种(*H. spec.*)。

[0975] 蠕虫的病原性体内寄生虫包括扁形动物门(*Platyhelmintha*) (例如，单殖亚纲(*Monogenea*)、绦虫类(*cestodes*)和吸虫类(*trematodes*))、线虫类(*nematodes*)、棘头动物门(*Acanthocephala*)和舌形动物门(*Pentastoma*)。这些包括：

[0976] 单殖亚纲(*Monogenea*)：例如：三代虫属种(*Gyrodactylus spp.*)、指环虫属种(*Dactylogyrus spp.*)、多盘吸虫属种(*Polystoma spp.*)；

[0977] 绦虫：假叶目(*Pseudophyllidea*)的绦虫，例如：裂头属种(*Diphyllobothrium spp.*)、迭宫绦虫属种(*Spirometra spp.*)、裂头绦虫属种(*Schistocephalus spp.*)、舌状绦虫属种(*Ligula spp.*)、吸叶绦虫属种(*Bothridium spp.*)、大复殖孔绦虫属种(*Diplogonoporus spp.*)；

[0978] 圆叶目(*Cyclophyllida*)的绦虫，例如：中带绦虫属种(*Mesocestoides spp.*)、裸头绦虫属种(*Anoplocephala spp.*)、副裸头属种(*Paranoplocephala spp.*)、莫尼茨属种(*Moniezia spp.*)、遂体绦虫属种(*Thysanosoma spp.*)、曲子宫绦虫属种(*Thysaniezia spp.*)、无卵黄腺属种(*Avitellina spp.*)、斯泰勒绦虫属种(*Stilesia spp.*)、鸣绦虫属种(*Cittotaenia spp.*)、*Andyra*属种、伯特绦虫属种(*Bertiella spp.*)、带绦虫属种(*Taenia spp.*)、棘球属种(*Echinococcus spp.*)、泡尾带属种(*Hydatigera spp.*)、戴维绦虫属种(*Davainea spp.*)、瑞立绦虫属种(*Raillietina spp.*)、膜壳绦虫属种(*Hymenolepis spp.*)、*Echinolepis*属种、*Echinocotyle*属种、两睾绦虫属种(*Diorchis spp.*)、复孔绦虫属种(*Dipylidium spp.*)、*Joyeuxiella*属种、倍殖孔绦虫(*Diplopylidium spp.*)；

[0979] 吸虫：复殖目(*Digenea*)的吸虫，例如：双穴吸虫属种(*Diplostomum spp.*)、茎双穴吸虫属种(*Posthodiplostomum spp.*)、血吸虫属种(*Schistosoma spp.*)、毛毕吸虫属种(*Trichobilharzia spp.*)、鸟毕吸虫属种(*Ornithobilharzia spp.*)、澳毕吸虫属种(*Austroilharzia spp.*)、巨毕吸虫属种(*Gigantobilharzia spp.*)、彩蝴吸虫属种(*Leucochloridium spp.*)、短咽吸虫属种(*Brachylaima spp.*)、棘口吸虫属种

(*Echinostoma* spp.)、棘缘吸虫属种(*Echinoparyphium* spp.)、棘隙吸虫属种(*Echinochasmus* spp.)、寡肉吸虫属种(*Hypoderaeum* spp.)、肝片吸虫属种(*Fasciola* spp.)、拟片形吸虫属种(*Fascioloides* spp.)、姜片吸虫属种(*Fasciolopsis* spp.)、环肠吸虫属种(*Cyclocoelum* spp.)、盲腔属种(*Typhlocoelum* spp.)、同端盘吸虫属种(*Paramphistomum* spp.)、杯殖吸虫属种(*Calicophoron* spp.)、殖盘吸虫属种(*Cotylophoron* spp.)、巨盘吸虫属种(*Gigantocotyle* spp.)、菲策吸虫属种(*Fischoederius* spp.)、腹袋吸虫属种(*Gastrothylacus* spp.)、背孔吸虫属种(*Notocotylus* spp.)、下弯吸虫属种(*Catatropis* spp.)、斜睾吸虫属种(*Plagiorchis* spp.)、前殖吸虫属种(*Prosthogonimus* spp.)、双腔吸虫属种(*Dicrocoelium* spp.)、肠吸虫属种(*Eurytrema* spp.)、鲑吸虫属种(*Troglootrema* spp.)、肺吸虫属种(*Paragonimus* spp.)、肛瘤吸虫属种(*Collyriclum* spp.)、小叶吸虫属种(*Nanophyetus* spp.)、后睾吸虫属种(*Opisthorchis* spp.)、支睾吸虫属种(*Clonorchis* spp.)、次睾吸虫属种(*Metorchis* spp.)、异形吸虫属种(*Heterophyes* spp.)、后殖吸虫属种(*Metagonimus* spp.)；

[0980] 线虫：毛形亚目(*Trichinellida*)，例如：鞭虫属种(*Trichuris* spp.)、毛细线虫属种(*Capillaria* spp.)、*Paracapillaria*属种、鞘线虫属种(*Eucoleus* spp.)、*Trichomosoides*属种、旋毛线虫属种(*Trichinella* spp.)；

[0981] 垫刃目(*Tylenchida*)的线虫，例如：细丝鲶属种(*Micronema* spp.)、类圆线虫属种(*Strongyloides* spp.)；

[0982] 杆形目(*Rhabditida*)的线虫，例如：圆线虫属种(*Strongylus* spp.)、三齿线虫属种(*Triodontophorus* spp.)、食道齿属种(*Oesophagodontus* spp.)、毛样线虫属种(*Trichonema* spp.)、辐首线虫属种(*Gyallocephalus* spp.)、*Cylindropharynx*属种、杯口线虫属种(*Poteriostomum* spp.)、*Cyclococercus*属种、*Cylicostephanus*属种、结节线虫属种(*Oesophagostomum* spp.)、夏柏特线虫属种(*Chabertia* spp.)、肾线虫属种(*Stephanurus* spp.)、钩口线虫属种(*Ancylostoma* spp.)、弯口属种(*Uncinaria* spp.)、板口线虫属种(*Necator* spp.)、仰口线虫属种(*Bunostomum* spp.)、球头线虫属种(*Globocephalus* spp.)、比翼属种(*Syngamus* spp.)、*Cyathostoma*属种、后圆线虫属种(*Metastrongylus* spp.)、网尾线虫属种(*Dictyocaulus* spp.)、缪勒线虫属种(*Muellerius* spp.)、原圆线虫属种(*Protostrongylus* spp.)、*Neostrongylus*属种、囊尾线虫属种(*Cystocaulus* spp.)、肺圆线虫属种(*Pneumostomum* spp.)、尖尾线虫属种(*Spicocaulus* spp.)、鹿圆线虫属种(*Elaphostomum* spp.)、副鹿圆线虫属种(*Parelaphostomum* spp.)、环棘属种(*Crenosoma* spp.)、*Paracrenosoma*属种、*Oslerus*属种、管圆线虫属种(*Angiostrongylus* spp.)、猫圆线虫属种(*Aelurostrongylus* spp.)、类丝虫属种(*Filaroides* spp.)、*Parafilaroides*属种、毛圆线虫属种(*Trichostrongylus* spp.)、血矛线虫属种(*Haemonchus* spp.)、胃线虫属种(*Ostertagia* spp.)、背带线虫属种(*Teladorsagia* spp.)、马歇尔线虫属种(*Marshallagia* spp.)、古柏线虫属种(*Cooperia* spp.)、日本圆线虫属种(*Nippostrongylus* spp.)、螺旋线虫属种(*Heligmosomoides* spp.)、细颈线虫属种(*Nematodirus* spp.)、猪圆线虫属种(*Hyostrongylus* spp.)、尖柱线虫属种(*Obeliscoides* spp.)、裂口线虫属种(*Amidostomum* spp.)、盘头线虫属种(*Ollulanus* spp.)；

[0983] 旋尾目(*Spirurida*)的线虫，例如：尖尾线虫属种(*Oxyuris* spp.)、蛲虫属种

(Enterobius spp.)、栓尾线虫属种 (Passalurus spp.)、管状线虫属种 (Syphacia spp.)、无刺线虫属种 (Aspiculuris spp.)、异刺线虫属种 (Heterakis spp.)；蛔虫属种 (Ascaris spp.)、弓蛔线虫属种 (Toxascaris spp.)、弓蛔虫属种 (Toxocara spp.)、贝利蛔线虫属种 (Baylisascaris spp.)、副蛔虫属种 (Parascaris spp.)、异尖属种 (Anisakis spp.)、蛔型属种 (Ascaridia spp.)、颚口线虫属种 (Gnathostoma spp.)、泡翼属种 (Physaloptera spp.)、吸吮线虫属种 (Thelazia spp.)、筒线虫属种 (Gongylonema spp.)、丽线虫属种 (Habronema spp.)、副丽线虫属种 (Parabronema spp.)、德拉西线虫属种 (Draschia spp.)、龙线虫属种 (Dracunculus spp.)、冠丝虫属种 (Stephanofilaria spp.)、副丝虫属种 (Parafilaria spp.)、腹腔丝虫属种 (Setaria spp.)、罗阿丝虫属种 (Loa spp.)、恶丝虫属种 (Dirofilaria spp.)、光丝虫属种 (Litomosoides spp.)、布鲁丝虫属种 (Brugia spp.)、吴策线虫属种 (Wuchereria spp.)、盘尾丝虫属种 (Onchocerca spp.)、旋毛线虫属种 (Spirocerca spp.)；

[0984] 棘头纲 (Acanthocephala)：寡棘吻目 (Oligacanthorhynchida)，例如：猪巨吻棘头虫属种 (Macracanthorhynchus spp.)、Prosthenorchis 属种；多形目 (Polymorphida)，例如：细颈属种 (Filicollis spp.)；链珠目 (Moniliformida)，例如：念珠棘虫属种 (Moniliformis spp.)；

[0985] 棘吻目 (Echinorhynchida)，例如，棘头花属种 (Acanthocephalus spp.)、鱼棘头虫属种 (Echinorhynchus spp.)、Leptorhynchoides 属种；

[0986] 舌形动物门 (Pentastoma)：蛇舌状虫目 (Porocephalida)，例如舌形虫属种 (Linguatula spp.)。

[0987] 在兽医领域和动物饲养中，式 (I) 的化合物通过本领域通常已知的方法 (如经肠内、肠外、真皮或鼻途径) 以合适制剂的形式给予。给予可为预防性或治疗性的。

[0988] 因此，本发明的一个实施方案涉及式 (I) 的化合物作为药物的用途。

[0989] 另一个方面涉及式 (I) 的化合物作为抗体内寄生虫剂 (antiendoparasitic agent)、特别是杀蠕虫剂 (helminthocidal agent) 或抗原生动物剂 (antiprotozoic agent) 的用途。式 (I) 的化合物适合于例如在动物育种中、在动物饲养中、在动物居所中和在卫生领域中用作抗体内寄生虫剂，尤其是杀蠕虫剂或抗原生动物剂。

[0990] 另一个方面还涉及式 (I) 的化合物作为抗体外寄生虫剂 (antiektoparasitic agent)、特别是杀节肢动物剂如杀昆虫剂或杀螨剂的用途。另一个方面涉及式 (I) 的化合物例如在动物饲养中、在动物育种中、在动物居所中或在卫生领域中作为抗体外寄生虫剂、特别是杀节肢动物剂如杀昆虫剂或杀螨剂的用途。

[0991] 病媒防治 (vector control)

[0992] 式 (I) 的化合物还可用于病媒防治。在本发明的上下文中，病媒为能够将病原体 (例如病毒、蠕虫、单细胞生物和细菌) 从贮主 (reservoir) (植物、动物、人类等) 传播至宿主的节肢动物，尤其是昆虫或蛛形纲动物。可将病原体机械地传播至宿主 (例如通过无刺苍蝇传播沙眼) 或在注射后传播至宿主 (例如通过蚊子传播疟原虫)。

[0993] 病媒及其传播的疾病或病原体的实例为：

[0994] 1) 蚊子

[0995] -按蚊：疟疾、丝虫病；

- [0996] -库蚊:日本脑炎、丝虫病、其他病毒性疾病、蠕虫的传播;
- [0997] -伊蚊:黄热病、登革热、丝虫病、其他病毒性疾病;
- [0998] -蚋科:蠕虫、特别是旋盘尾丝虫 (*Onchocerca volvulus*) 的传播;
- [0999] 2) 虱:皮肤感染、流行性斑疹伤寒;
- [1000] 3) 蚤:瘟疫、地方性斑疹伤寒;
- [1001] 4) 蝇:昏睡病(锥虫病);霍乱、其他细菌性疾病;
- [1002] 5) 螨:螨病、流行性斑疹伤寒、立克次氏体痘、土拉菌病、圣路易斯型脑炎、蜱媒脑炎(TBE)、克里米亚-刚果出血热(Crimean-Congo haemorrhagic fever)、疏螺旋体病(borreliosis);
- [1003] 6) 蜱:borellioses,如杜通氏螺旋体(*Borrelia duttoni*)、蜱媒脑炎、Q热(伯氏考克斯体(*Coxiella burnetii*))、巴贝西虫病(babesioses)(犬巴贝斯虫(*Babesia canis*canis))。
- [1004] 在本发明的上下文中,病媒的实例为可将植物病毒传播至植物的昆虫,例如蚜虫、蝇、叶蝉或蓟马。能够传播植物病毒的其他病媒为叶螨、虱、甲虫和线虫。
- [1005] 在本发明的上下文中,病媒的其他实例为可将病原体传播至动物和/或人类的昆虫和蛛形纲动物,如蚊子,尤其是伊蚊属,按蚊属例如冈比亚按蚊(*A.gambiae*)、阿拉伯按蚊(*A.arabiensis*)、不吉按蚊(*A.funestus*)、大劣按蚊(*A.dirus*) (疟疾),和库蚊属;虱;蚤;蝇;螨;和蜱。
- [1006] 如果式(I)的化合物为破坏抗性(resistance-breaking)的,则病媒的防治也是可行的。
- [1007] 式(I)的化合物适用于预防通过病媒传播的疾病和/或病原体。因此,本发明的另一个方面为式(I)的化合物例如在农业、园艺、林业、花园和休闲设施中,以及在材料和储藏产品的保护中用于病媒防治的用途。
- [1008] 工业材料的保护
- [1009] 式(I)的化合物适合用于保护工业材料免受昆虫的侵袭或破坏,所述昆虫例如来自鞘翅目、膜翅目、等翅目、鳞翅目、啮虫目和衣鱼目。
- [1010] 在本上下文中,工业材料应理解为意指无生命材料,如优选塑料、粘合剂、胶料、纸和卡片、皮革、木材、加工木制品和涂层组合物。特别优选本发明用于保护木材的用途。
- [1011] 在另一个实施方案中,将式(I)的化合物与至少一种其他杀昆虫剂和/或至少一种杀真菌剂一起使用。
- [1012] 在另一个实施方案中,式(I)的化合物以即用型农药的形式存在,即其可不经进一步的修饰而应用于所述材料。合适的其他杀昆虫剂或杀真菌剂特别为上述那些。
- [1013] 出人意料地,还已发现,式(I)的化合物可用于保护与盐水或微咸水接触的物体(特别是船体、筛、网、建筑物、系泊用具和信号系统)免受污损。式(I)的化合物同样可单独地或与其它活性化合物结合用作防污剂。
- [1014] 卫生领域中的动物害虫的防治
- [1015] 式(I)的化合物适合用于防治卫生领域中的动物害虫。更特别地,本发明可用于家用保护领域、卫生保护领域和储藏产品的保护中,特别是用于防治在封闭空间(例如住所、工厂车间、办公室、车辆舱室)中遇到的昆虫、蛛形纲动物和螨。为了防治动物害虫,将式(I)

的化合物单独使用或与其他活性化合物和/或助剂结合使用。它们优选用于家用杀昆虫剂产品中。式(I)的化合物对敏感和抗性物种以及对所有发育阶段均有效。

[1016] 这些害虫包括例如以下害虫:蛛形纲,蝎目(Scorpiones)、蜘蛛目(Araneae)和盲蛛目(Opiliones);唇足纲和倍足纲;昆虫纲,蜚蠊目、鞘翅目、革翅目、双翅目、异翅目、膜翅目、等翅目、鳞翅目、虱目、啮虫目、跳跃目或直翅目、蚤目和衣鱼目;以及软甲亚纲(Malacostraca),等足目。

[1017] 以例如下列形式进行施用:气雾剂;无压喷雾产品,例如泵式喷雾剂和雾化喷雾剂;自动弥雾体系;喷雾剂;泡沫剂;凝胶剂;具有由纤维素或塑料制成的蒸发片剂的蒸发产品;液体蒸发剂;凝胶和膜蒸发剂;推进器驱动的蒸发剂;无能量或无动力的蒸发体系;捕蛾纸、捕蛾袋和捕蛾胶;作为颗粒剂或粉末剂;用在撒播的饵料中或饵站中。

[1018] 方法和中间体的说明

[1019] 以下制备实施例和用途实施例用于说明本发明,而非限制本发明。产物通过¹H-NMR谱和/或LC/MS(液相色谱质谱联用)表征。

[1020] logP值按照OECD Guideline 117(EC Directive 92/69/EEC)通过HPLC(高效液相色谱法)使用反相(RP)柱(C18)由以下方法测定:

[1021] [a]酸性范围内的LC-MS测定在pH 2.7下用0.1%甲酸水溶液和乙腈(含有0.1%甲酸)作为洗脱液进行;线性梯度为10%乙腈至95%乙腈。

[1022] [b]中性范围内的LC-MS测定在pH 7.8下用0.001摩尔的碳酸氢铵水溶液和乙腈作为洗脱液进行;线性梯度为10%乙腈至95%乙腈。

[1023] 使用具有已知logP值(logP值基于保留时间通过两个连续链烷酮之间的线性内插来测定)的非支化链烷-2-酮(具有3至16个碳原子)进行校正。

[1024] NMR谱使用安装有流量探头(体积60μl)的Bruker Avance 400进行测定。在个别情况下,NMR谱使用Bruker Avance II 600进行测量。

[1025] 所选实施例的¹H-NMR数据以¹H-NMR峰列表的形式说明。对于每个信号峰,首先列出以ppm计的δ值,然后在圆括号内列出信号强度。对于不同信号峰的δ值-信号强度数对,以分号彼此分隔列出。

[1026] 因此,一个实施例的峰列表具有以下形式:

[1027] δ₁(强度1);δ₂(强度2);……;δ_i(强度i);……;δ_n(强度n)

[1028] 尖峰信号的强度与在NMR谱的打印实例中以cm计的信号高度相关,并且示出了信号强度的真实比例。在宽峰信号的情况下,可以示出信号的若干峰值或中值,以及其与谱图中的最强信号相比的相对强度。

[1029] 使用四甲基硅烷和/或溶剂的化学位移校准¹H-NMR谱的化学位移,特别是在DMSO中测量的光谱的情况下。因此,四甲基硅烷峰可以但并不必然在NMR峰列表中出现。

[1030] ¹H-NMR峰的列表与常规¹H-NMR打印件相似,因此通常包含在常规NMR解析中列出的所有峰。

[1031] 此外,如同常规¹H-NMR打印件,它们可以显示出溶剂信号、目标化合物的立体异构体(其同样由本发明提供)的信号、和/或杂质的峰的信号。

[1032] 在记录溶剂和/或水的δ范围内的化合物信号时,¹H-NMR峰的列表表示出标准溶剂峰,例如DMSO-D₆中的DMSO的峰和水的峰,它们通常具有平均较高的强度。

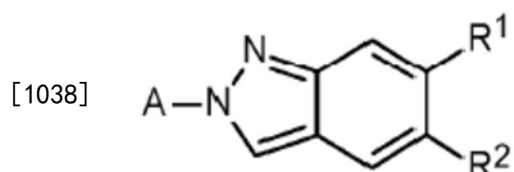
[1033] 目标化合物的立体异构体的峰和/或杂质的峰通常具有比目标化合物(例如,纯度>90%)的峰平均更低的强度。

[1034] 这类立体异构体和/或杂质对于特定的制备方法而言是可以是典型的。因此,在这种情况下,通过参考“副产物指纹(by-product fingerprint)”,它们的峰可有助于识别我们的制备方法的再现性。

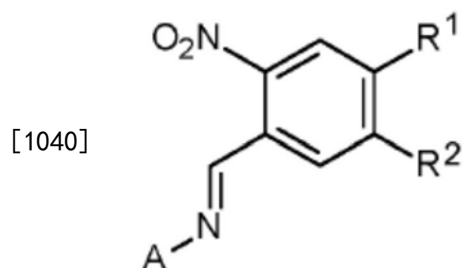
[1035] 如果需要的话,专业人员通过已知方法(MestreC,ACD模拟,以及凭经验估算的预期值)来计算目标化合物的峰,并且可任选地使用另外的强度滤波器来分离目标化合物的峰。这种分离与常规¹H-NMR解析中对所述峰的选择相似。

[1036] ¹H-NMR峰列表的其他细节可见于Research Disclosure Database Number564025中。

[1037] 式(I)的4,5-二取代的2-(杂芳基)吲唑的通用合成;实施例1至52:



[1039] 步骤1:合成式(A-3)的化合物



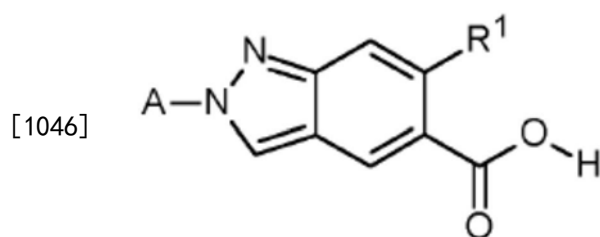
[1041] 将19.6mmol杂环氨基化合物(A-2)、1.0mmol对甲苯磺酸(PTSA)、5.9mmol 4A分子筛和硫酸镁添加至119.6mmol式(A-1)的邻硝基苯甲醛在75mmol甲苯中的溶液中。然后,将反应混合物在回流温度下搅拌18小时。薄层色谱图(流动相:乙酸乙酯)显示反应已结束。过滤反应混合物,滤液在浓缩后得到粗产物(A-3),其在不经进一步纯化而进一步反应。

[1042] 步骤2:合成式(I)的4,5-二取代的2-(杂芳基)吲唑

[1043] 在室温下,将58.8mmol亚磷酸三乙酯添加至19.6mmol式(A-3)的化合物中。然后,将反应混合物在140℃下搅拌约18小时。薄层色谱图(流动相:石油醚:乙酸乙酯=1:1)显示反应已结束。将反应混合物在减压下浓缩后,通过CombiFlash色谱法(流动相梯度:100%石油醚至70%乙酸乙酯/石油醚)纯化剩余的残留物。

[1044] 式(I, R²=COOH)的4-取代的2-(杂芳基)吲唑-5-羧酸的通用合成

[1045] 方法A:

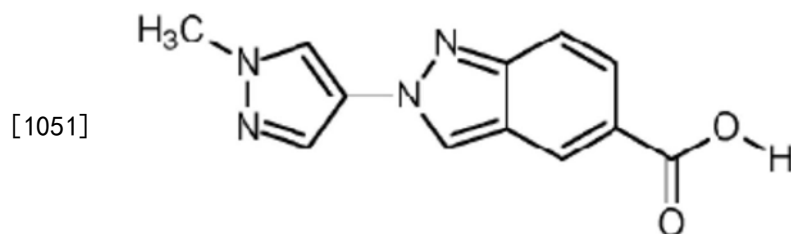


[1047] 在室温下,将21.1mmol氢氧化钠水溶液添加至在10ml四氢呋喃和10ml水的混合物中的7.03mmol式(I; $R^2=C(=O)OCH_3$)的化合物中。然后,将反应混合物在70℃下搅拌约18小时。薄层色谱图(流动相:石油醚:乙酸乙酯=1:1)显示反应已结束。将反应混合物在减压下浓缩后,用12N的盐酸将剩余的残留物调节至pH=3。其后,将沉淀的固体滤出、用水洗涤并干燥。

[1048] 方法B:

[1049] 将1当量式(I; $R^2=C(=O)OCH_3$)的化合物溶解在甲醇中(3ml/mmol),并在室温下加入1.5当量1M氢氧化锂溶液。然后,将反应混合物在50℃下搅拌2小时。随后,通过添加1M盐酸将反应混合物调节至pH=3。如果固体已形成,则将其滤出并干燥。否则,用二氯甲烷(3×3 ml/mmol)萃取反应溶液。将合并的有机相经硫酸镁干燥,并在减压下浓缩。

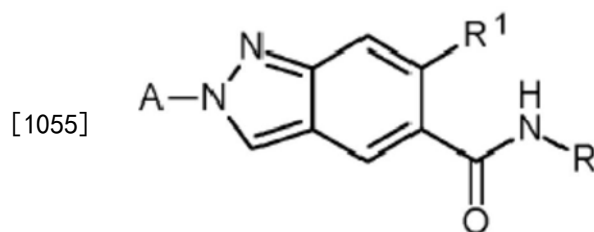
[1050] 2-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)-2H-吡唑-5-羧酸(I, A=1-甲基-1H-吡唑-4-基; $R^1=H$, $R^2=C(=O)OH$)



[1052] 该化合物由3.46g (13.5mmol) 2-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)-2H-吡唑-5-羧酸甲酯根据所述通用合成制备。得到2.87g (收率88%) 题述化合物。

[1053] APCI MS, $m/z=243 [M+H]^+$

[1054] 式(I, $R^2=CONHR$)的4-取代的2-(杂芳基)吡唑-5-羧酰胺的通用合成



[1056] a) 羰基二咪唑(CDI)方法:

[1057] 在第一反应步骤中,在室温下,将134mg (0.84mmol) 羰基二咪唑(CDI)添加至0.84mmol 2-(杂芳基)吡唑-5-羧酸在8ml N,N-二甲基甲酰胺中的溶液中,然后将反应混合物搅拌2小时。在第二反应步骤中,在室温下,将1.04mmol 60%纯的氢化钠添加至在8ml N,N-二甲基甲酰胺中的1.04mmol以该方式制备的反应组分中。1小时后,添加0.84mmol相应的胺,并将混合物在室温下再搅拌18小时。对于后处理,添加水,在减压下浓缩反应物,并通过柱色谱法在硅胶上(流动相梯度:二氯甲烷:甲醇=50:1至5:1)纯化剩余的残留物。

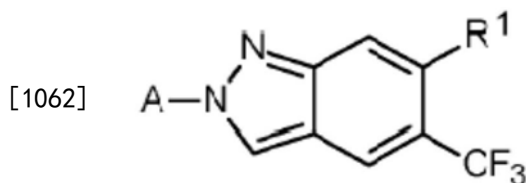
[1058] b) 碳酰氯方法:

[1059] 在第一反应步骤中,在0℃下,将5滴N,N-二甲基甲酰胺和3mmol碳酰氯添加至1.0mmol 2-(杂芳基)吡唑-5-羧酸在12ml二氯甲烷中的溶液中。然后,将反应混合物在室温下搅拌3小时。在减压下浓缩反应混合物,得到2-(杂芳基)吡唑-5-碳酰氯。

[1060] 在第二反应步骤中,在室温下搅拌在15ml二氯甲烷中的1.0mmol 2-(杂芳基)吡

唑-5-碳酰氯,并加入3.0mmol相应的胺和4mmol N,N-二异丙基乙胺(DIPEA)。然后,将反应混合物在室温下搅拌18小时。对于后处理,将反应混合物在减压下浓缩,并通过CombiFlash(流动相梯度:二氯甲烷至4%甲醇在二氯甲烷中)纯化剩余的残留物。

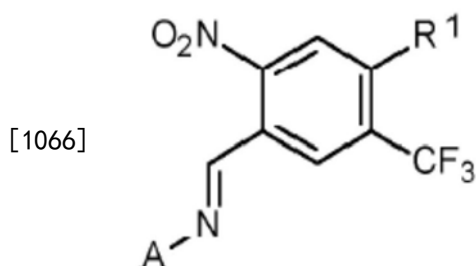
[1061] 式(I, $R^2=CF_3$)的4-取代的2-(杂芳基)-5-三氟甲基吡唑的通用合成



[1063] 步骤1:合成2-硝基-5-(三氟甲基)苯甲醛(A-1)

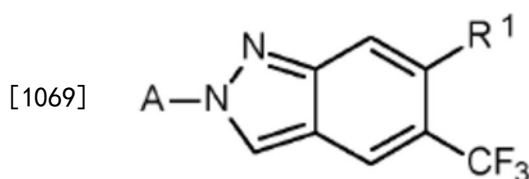
[1064] 在室温下,将63.7mmol N,N-二甲基甲酰胺0,0-二甲基乙缩醛滴加至4.9mmol 2-甲基-1-硝基-4-(三氟甲基)苯在15ml N,N-二甲基甲酰胺中的溶液中。然后,将反应混合物在140℃下搅拌18小时。然后,将反应混合物在减压下浓缩,并将15ml四氢呋喃和15ml水添加至剩余的残留物。然后,加入147mmol高碘酸钠($NaIO_4$),并将反应混合物在室温下再搅拌18小时。然后,用二氯甲烷萃取反应混合物,并在减压下浓缩有机相。通过ISCO(流动相梯度:100%石油醚至10%乙酸乙酯在石油醚中)对剩余的残留物进行色谱分析。

[1065] 步骤2:合成式(A-3; $R^1=H$; $R^2=CF_3$)的化合物



[1067] 将1.095mmol杂环氨基化合物(A-2)、0.046mmol PTSA、0.27mmol 4A分子筛和硫酸镁添加至0.913mmol 2-硝基-5-三氟甲基苯甲醛(A-1, $R^1=H$)在75ml甲苯中的溶液中。然后,将反应混合物在回流温度下搅拌18小时。过滤反应混合物,滤液在浓缩后得到粗产物(A-3),其不经进一步纯化而进一步反应。

[1068] 步骤3:合成式(I; $R^1=H$; $R^2=CF_3$)的4-取代的2-(杂芳基)-5-三氟甲基吡唑



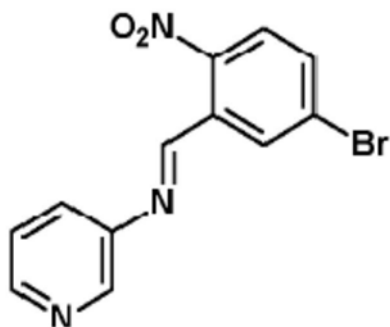
[1070] 在室温下,将2.739mmol亚磷酸三乙酯添加至0.913mmol式(A-3)的化合物中。然后,将反应混合物在140℃下搅拌约18小时。薄层色谱图(流动相:石油醚:乙酸乙酯=1:1)显示反应已结束。将反应混合物在减压下浓缩后,通过ISCO(流动相梯度:100%石油醚至20%乙酸乙酯/石油醚)对剩余的残留物进行色谱分析。

[1071] 实施例49:5-[2-氟-4-甲基-5-(2,2,2-三氟乙基硫烷基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑

[1072] 步骤1:

[1073] 合成(E/Z)-N-[(5-溴-2-硝基苯基)亚甲基]吡啶-3-胺

[1074]



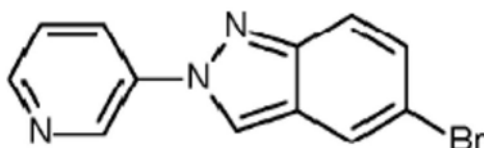
[1075] 将35.75g (155.42mmol) 5-溴-2-硝基苯甲醛、15.04g (159.81mmol) 吡啶-3-胺和200ml乙醇添加至500ml圆底烧瓶中。然后,将反应混合物在80℃的油浴中搅拌约18小时。通过LCMS监测反应过程。其后,在减压下浓缩反应混合物。得到45g褐色固体形式的粗(E/Z)-N-[(5-溴-2-硝基苯基)亚甲基]吡啶-3-胺。

[1076] LC-MS (ES, m/z) : 305.9 [M+H]

[1077] 步骤2:

[1078] 合成5-溴-2-(3-吡啶基)-2H-吡唑

[1079]



[1080] 在500ml圆底烧瓶中对45g (147.00mmol) (E/Z)-N-[(5-溴-2-硝基苯基)亚甲基]吡啶-3-胺和75g (451.38mmol) 亚磷酸三乙酯进行搅拌。然后,将溶液在90℃的油浴中搅拌约18小时。通过LCMS监测反应过程。然后,用氢氧化钠洗涤反应混合物。将形成的溶液用50ml乙酸乙酯萃取三次并合并有机相。然后,将有机相用50ml水洗涤三次,并在干燥后于减压下浓缩。通过柱色谱法使用梯度乙酸乙酯:石油醚=(25:75)纯化剩余的残留物。得到12.3g (收率:理论值的30%)黄色固体形式的5-溴-2-(3-吡啶基)-2H-吡唑。

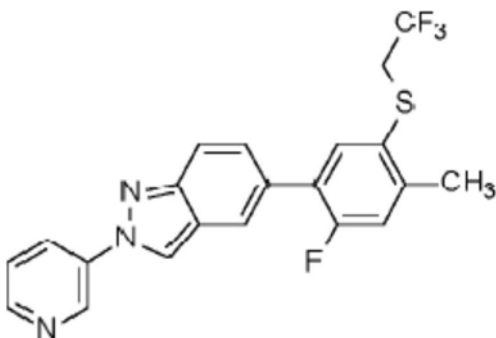
[1081] LC-MS (ES, m/z) : 274.0 [M+H] 和 276.0 [M+H]

[1082] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, CDCl_3) : δ = 9.21 (s, 1H) , 8.71 (d, J = 4.0Hz, 1H) , 8.44 (s, 1H) , 8.32 (d, J = 7.2Hz, 1H) , 7.92 (s, 1H) , 7.70 (d, J = 9.2Hz, 1H) , 7.54-7.57 (m, 1H) , 7.43 (d, J = 9.2Hz, 1H) ppm。

[1083] 步骤3:

[1084] 5-[2-氟-4-甲基-5-(2,2,2-三氟乙基硫烷基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑

[1085]

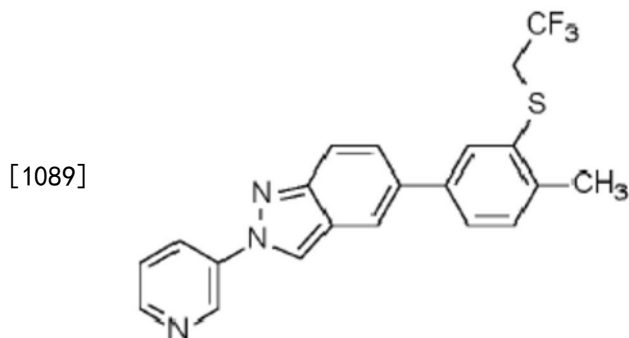


[1086] 与US 2013/0267493的反应过程类似,将77mg (0.73mmol) 碳酸钠在375 μ l水和

1.5ml 1,4-二氧杂环己烷中的溶液添加至100mg (365 μ mol) 5-溴-2-(3-吡啶基) 吡唑 (参见实施例49, 步骤2) 和105mg (392 μ mol) [2-氟-4-甲基-5-(2,2,2-三氟乙基硫烷基) 苯基] 硼酸的混合物中。用氩气流反复吹扫反应混合物, 加入15mg (19 μ mol) [1,1'-二(二苯基膦基) 二茂铁] 二氯化钨(II) 并关闭容器。将混合物在CEM Discover微波反应器中于90℃下加热40分钟, 并在冷却至室温后, 通过用乙酸乙酯清洗的深度过滤器进行过滤。反应总共进行三次, 并在纯化前将各批料合并。在减压下除去溶剂后, 通过MPLC在硅胶上(梯度: 乙酸乙酯/环己烷0:100→50:50) 对残留物进行色谱分离。得到392mg (纯度93%, 收率86%) 的5-[2-氟-4-甲基-5-(2,2,2-三氟乙基硫烷基) 苯基]-2-(3-吡啶基) 吡唑。

[1087] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, d_6 -DMSO) : δ = 9.374 (3.5) ; 9.367 (3.5) ; 9.306 (5.9) ; 9.305 (5.9) ; 8.686 (2.4) ; 8.682 (2.6) ; 8.674 (2.5) ; 8.671 (2.6) ; 8.541 (1.3) ; 8.537 (1.5) ; 8.534 (1.5) ; 8.531 (1.3) ; 8.520 (1.5) ; 8.516 (1.5) ; 8.513 (1.7) ; 8.510 (1.4) ; 8.228 (0.3) ; 7.975 (3.7) ; 7.860 (2.7) ; 7.837 (3.1) ; 7.774 (3.1) ; 7.754 (3.2) ; 7.687 (1.9) ; 7.675 (1.9) ; 7.666 (1.9) ; 7.655 (1.9) ; 7.558 (1.3) ; 7.553 (2.2) ; 7.549 (1.3) ; 7.535 (1.1) ; 7.531 (2.0) ; 7.527 (1.1) ; 7.338 (2.8) ; 7.309 (2.7) ; 4.066 (1.3) ; 4.040 (4.2) ; 4.014 (4.4) ; 3.988 (1.5) ; 3.335 (28.4) ; 2.893 (0.4) ; 2.528 (0.5) ; 2.514 (12.2) ; 2.510 (24.6) ; 2.505 (32.5) ; 2.501 (24.0) ; 2.496 (11.9) ; 2.453 (16.0) ; 2.406 (0.4) ; 1.397 (1.7) 。

[1088] 实施例50: 5-[4-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基硫烷基) 苯基]-2-(3-吡啶基) 吡唑

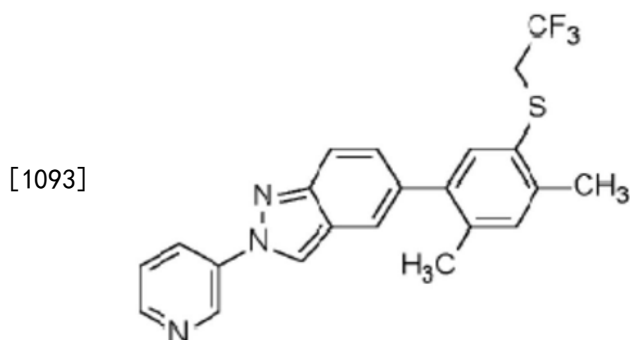


[1090] 5-[4-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基硫烷基) 苯基]-2-(3-吡啶基) 吡唑的制备以类似于5-[2-氟-4-甲基-5-(2,2,2-三氟乙基硫烷基) 苯基]-2-(3-吡啶基) 吡唑的合成来进行。此处, 使用100mg (365 μ mol) 5-溴-2-(3-吡啶基) 吡唑 (参见实施例49, 步骤2) 和98mg (0.39mmol) [4-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基硫烷基) 苯基] 硼酸。反应进行两次, 并在纯化前将各批料合并。得到149mg 5-[4-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基硫烷基) 苯基]-2-(3-吡啶基) 吡唑 (纯度97%, 收率50%) 。

[1091] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, d_6 -DMSO) : δ = 9.377 (3.4) ; 9.371 (3.5) ; 9.274 (5.9) ; 9.272 (6.2) ; 8.678 (2.3) ; 8.675 (2.6) ; 8.666 (2.5) ; 8.663 (2.7) ; 8.542 (1.4) ; 8.539 (1.6) ; 8.536 (1.6) ; 8.532 (1.4) ; 8.522 (1.5) ; 8.518 (1.6) ; 8.515 (1.7) ; 8.511 (1.5) ; 8.072 (4.1) ; 7.858 (2.7) ; 7.855 (2.3) ; 7.851 (3.7) ; 7.847 (3.9) ; 7.835 (3.6) ; 7.731 (2.9) ; 7.727 (2.9) ; 7.708 (2.1) ; 7.704 (2.1) ; 7.681 (1.9) ; 7.669 (1.9) ; 7.660 (1.9) ; 7.648 (1.9) ; 7.587 (1.9) ; 7.583 (1.9) ; 7.568 (2.3) ; 7.563 (2.3) ; 7.380 (3.2) ; 7.360 (2.6) ; 4.171 (1.3) ; 4.145 (4.3) ; 4.119 (4.4) ; 4.093 (1.5) ; 3.349 (0.4) ; 3.334 (63.3) ; 2.673 (0.3) ; 2.526 (0.8) ; 2.513 (18.3) ; 2.509 (37.9) ; 2.504 (50.6) ; 2.499 (37.8) ; 2.495 (19.1) ; 2.416 (16.0) ; 2.331 (0.3) ; 1.397

(0.4)。

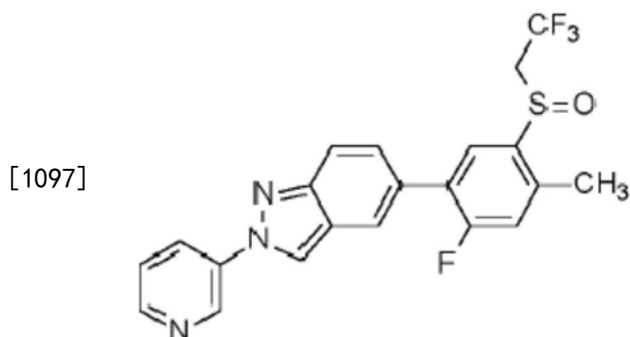
[1092] 实施例51: 5-[2,4-二甲基-5-(2,2,2-三氟乙基硫烷基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑



[1094] 与T.Furuya等, J. Am. Chem. Soc., 2010, 132, 3793-3807的反应过程类似, 在氩气下, 将60mg (0.43mmol) 碳酸钾、100mg (289 μ mol) 2-[2,4-二甲基-5-(2,2,2-三氟乙基硫烷基)苯基]-4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂硼杂环戊烷和17mg (15 μ mol) 四(三苯基膦)钯添加至79mg (0.28mmol) 5-溴-2-(3-吡啶基)吡唑 (参见实施例49, 步骤2) 在1.0ml 1,2-二甲氧基乙烷和1.0ml水中的溶液中。将反应混合物在100℃下搅拌3小时, 并在冷却至室温后添加水。进行相分离, 并用乙酸乙酯萃取水相。将合并的有机相用饱和氯化钠溶液洗涤并用硫酸钠干燥, 在减压下除去溶剂。通过MPLC在硅胶上 (梯度: 乙酸乙酯/环己烷0:100→60:40) 对残留物进行色谱分离, 然后通过HPLC (梯度: H₂O/乙腈90:10→0:100) 再进行一次。得到37mg (纯度98%, 收率30%) 5-[2,4-二甲基-5-(2,2,2-三氟乙基硫烷基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑。

[1095] ¹H-NMR (400.0MHz, d₆-DMSO): δ = 9.366 (3.2); 9.359 (3.2); 9.247 (5.6); 9.245 (5.6); 8.679 (2.2); 8.676 (2.4); 8.667 (2.3); 8.664 (2.4); 8.533 (1.3); 8.529 (1.5); 8.526 (1.5); 8.523 (1.3); 8.512 (1.4); 8.508 (1.5); 8.505 (1.6); 8.502 (1.4); 7.810 (2.7); 7.788 (3.0); 7.706 (4.1); 7.681 (1.8); 7.670 (1.7); 7.661 (1.7); 7.649 (1.7); 7.441 (5.8); 7.352 (2.5); 7.348 (2.5); 7.329 (2.3); 7.325 (2.4); 7.236 (4.8); 3.979 (1.3); 3.953 (4.0); 3.927 (4.2); 3.901 (1.4); 3.335 (13.6); 2.528 (0.4); 2.524 (0.6); 2.515 (8.4); 2.510 (17.5); 2.506 (23.5); 2.501 (17.5); 2.497 (8.7); 2.409 (14.6); 2.242 (16.0); 0.000 (1.1)。

[1096] 实施例52: 5-[2-氟-4-甲基-5-(2,2,2-三氟乙基亚磺酰基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑



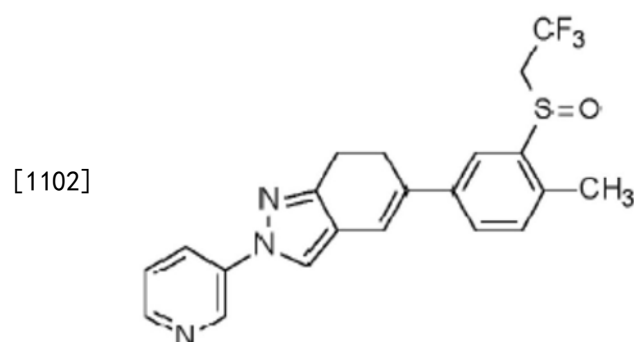
[1098] 在0℃下, 将56mg (0.23mmol) 间氯过氧苯甲酸 (纯度70%) 加入56mg (0.23mmol) 5-[2-氟-4-甲基-5-(2,2,2-三氟乙基硫烷基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑 (实施例49) 在5ml二氯甲烷中的溶液中。将反应混合物在室温下搅拌2小时, 然后添加饱和碳酸钠溶液。15分钟

后,进行相分离,用二氯甲烷萃取水相,并将合并的有机相经硫酸钠干燥。在减压下除去溶剂,并通过MPLC在硅胶上(梯度:乙酸乙酯/环己烷0:100→50:50)对残留物进行色谱分离。得到60mg(纯度100%,收率62%)5-[2-氟-4-甲基-5-(2,2,2-三氟乙基亚磺酰基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑。

[1099] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta=9.377$ (3.5); 9.371 (3.5); 9.323 (6.1); 9.321 (5.9); 8.692 (2.5); 8.688 (2.7); 8.680 (2.6); 8.677 (2.7); 8.545 (1.4); 8.541 (1.6); 8.538 (1.5); 8.535 (1.4); 8.524 (1.6); 8.521 (1.6); 8.518 (1.7); 8.514 (1.4); 8.059 (7.0); 8.039 (3.4); 7.900 (2.8); 7.878 (3.3); 7.693 (1.9); 7.692 (1.9); 7.681 (1.8); 7.673 (1.8); 7.661 (1.8); 7.660 (1.8); 7.613 (1.3); 7.609 (2.3); 7.605 (1.3); 7.591 (1.2); 7.587 (2.0); 7.582 (1.1); 7.447 (2.6); 7.418 (2.5); 4.298 (0.5); 4.288 (0.5); 4.271 (0.7); 4.261 (1.7); 4.243 (0.4); 4.233 (2.1); 4.203 (1.8); 4.193 (0.6); 4.175 (0.6); 4.166 (0.6); 3.329 (42.3); 2.677 (0.4); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.525 (1.4); 2.512 (28.8); 2.508 (57.1); 2.503 (74.6); 2.499 (54.0); 2.494 (25.9); 2.451 (16.0); 2.334 (0.4); 2.330 (0.5); 2.325 (0.4); 1.990 (0.7); 1.176 (0.4); 0.008 (1.4); 0.000 (41.3); -0.009 (1.3)。

[1100] 以类似的方式,表1和表3中所列的化合物74由化合物63通过氧化硫而获得。

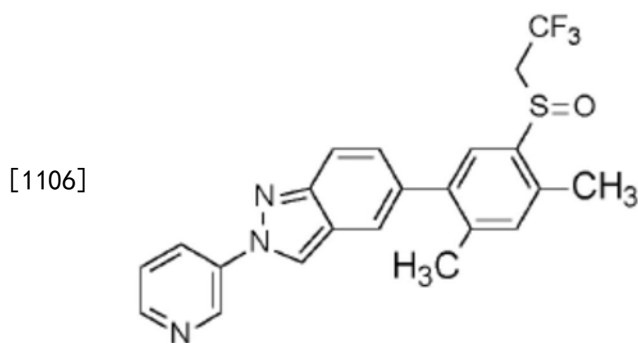
[1101] 实施例53:5-[4-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基亚磺酰基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑



[1103] 5-[4-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基亚磺酰基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑的制备以类似于实施例52的合成来进行。此处,使用104mg (217 μmol) 5-[4-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基硫烷基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑和54mg (0.22mmol) 间氯过氧苯甲酸(纯度70%)。得到64mg(纯度100%,收率71%)5-[4-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基亚磺酰基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑。

[1104] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta=9.379$ (3.6); 9.373 (3.7); 9.294 (6.2); 9.293 (6.0); 8.686 (2.5); 8.683 (2.7); 8.674 (2.7); 8.671 (2.7); 8.546 (1.4); 8.542 (1.7); 8.539 (1.6); 8.536 (1.4); 8.525 (1.6); 8.521 (1.7); 8.518 (1.8); 8.515 (1.5); 8.196 (4.0); 8.191 (4.2); 8.144 (4.2); 7.910 (2.1); 7.900 (2.9); 7.890 (2.4); 7.885 (2.4); 7.877 (3.7); 7.778 (2.9); 7.774 (2.8); 7.755 (2.0); 7.751 (2.0); 7.689 (1.9); 7.677 (1.9); 7.669 (1.9); 7.657 (1.8); 7.485 (3.0); 7.465 (2.7); 4.257 (0.4); 4.247 (0.6); 4.230 (0.8); 4.220 (1.9); 4.206 (1.8); 4.193 (2.0); 4.178 (2.0); 4.166 (0.8); 4.151 (0.7); 4.142 (0.4); 3.331 (136.6); 2.676 (0.5); 2.672 (0.7); 2.667 (0.5); 2.525 (1.9); 2.512 (38.7); 2.507 (77.7); 2.503 (102.1); 2.498 (75.9); 2.494 (38.6); 2.437 (16.0); 2.334 (0.5); 2.330 (0.7); 2.325 (0.5); 1.989 (0.6); 0.008 (0.5); 0.000 (14.6); -0.008 (0.7)。

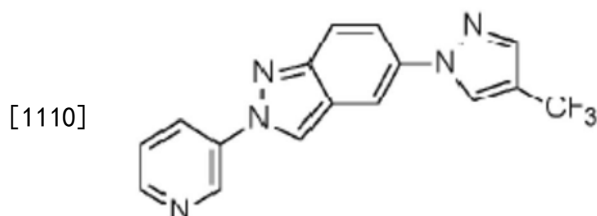
[1105] 实施例54:5-[2,4-二甲基-5-(2,2,2-三氟乙基亚磺酰基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡啶



[1107] 5-[2,4-二甲基-5-(2,2,2-三氟乙基亚磺酰基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡啶的制备以类似于实施例52的合成来进行。此处,使用117mg 5-[2,4-二甲基-5-(2,2,2-三氟乙基硫烷基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡啶(纯度<70%)和71mg (0.28mmol) 间氯过氧苯甲酸(纯度70%)。得到54mg (纯度100%) 5-[2,4-二甲基-5-(2,2,2-三氟乙基亚磺酰基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡啶。

[1108] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ =9.371 (3.3); 9.365 (3.5); 9.263 (5.7); 8.681 (2.5); 8.672 (2.5); 8.669 (2.6); 8.536 (1.6); 8.534 (1.6); 8.515 (1.7); 8.513 (1.7); 8.510 (1.4); 7.847 (2.6); 7.825 (2.9); 7.788 (4.4); 7.753 (6.3); 7.687 (1.8); 7.675 (1.8); 7.666 (1.8); 7.654 (1.7); 7.404 (2.3); 7.400 (2.4); 7.381 (2.2); 7.378 (2.2); 7.331 (4.8); 4.173 (1.1); 4.146 (3.4); 4.118 (3.5); 4.091 (1.2); 3.329 (83.0); 2.672 (0.9); 2.562 (0.3); 2.507 (107.3); 2.503 (138.4); 2.498 (111.3); 2.403 (14.9); 2.341 (16.0); 1.989 (0.6); 0.146 (0.9); 0.000 (175.9); -0.150 (0.9)。

[1109] 实施例55:2-(3-吡啶基)-5-[4-(三氟甲基)吡啶-1-基]吡啶

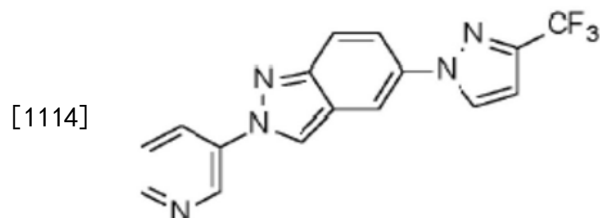


[1111] 与J.C.Antilla等,J.Org.Chem.,2004,69,5578-5587的反应过程类似,在氩气下,将在1.0ml脱气甲苯中的100mg (365 μmol) 5-溴-2-(3-吡啶基)吡啶(参见实施例49,步骤2)和20 μl (0.12mmol) 反式-N,N'-二甲基环己烷-1,2-二胺添加至12mg (63 μmol) 碘化亚铜(I)、41mg (0.30mmol) 4-(三氟甲基)-1H-吡啶和88mg (0.64mmol) 碳酸钾的混合物中。关闭容器,并将反应混合物在CEM Discover微波反应器中加热至120 $^{\circ}\text{C}$ 下,持续18小时。冷却至室温后,将混合物通过随后用乙酸乙酯清洗的深度过滤器进行过滤。在减压下除去溶剂后,通过MPLC在硅胶上(梯度:乙酸乙酯/环己烷0:100 \rightarrow 50:50)对残留物进行色谱分离。得到17mg (纯度94%,收率16%) 2-(3-吡啶基)-5-[4-(三氟甲基)吡啶-1-基]吡啶。

[1112] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ =9.379 (2.7); 9.361 (13.4); 9.259 (7.9); 9.210 (0.4); 8.695 (2.3); 8.686 (2.4); 8.550 (2.2); 8.547 (2.6); 8.544 (2.5); 8.541 (2.1); 8.529 (2.4); 8.526 (2.6); 8.523 (2.7); 8.520 (2.2); 8.285 (8.4); 8.237 (9.1); 7.947 (16.0);

7.943 (15.7) ; 7.693 (2.6) ; 7.681 (2.6) ; 7.672 (2.6) ; 7.660 (2.5) ; 5.759 (0.7) ; 3.333 (56.9) ; 2.678 (0.5) ; 2.673 (0.7) ; 2.527 (2.0) ; 2.513 (40.5) ; 2.509 (79.4) ; 2.505 (102.3) ; 2.500 (75.1) ; 2.336 (0.5) ; 2.331 (0.6) ; 1.245 (0.5) ; 1.230 (0.5) ; 0.146 (0.9) ; 0.022 (0.5) ; 0.008 (8.3) ; 0.000 (189.5) ; -0.009 (7.9) ; -0.150 (1.0) 。

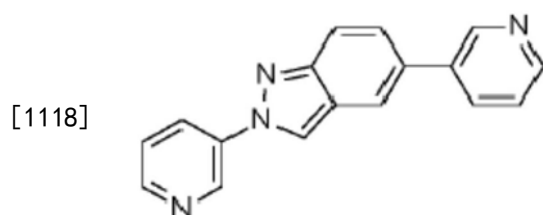
[1113] 实施例56: 2-(3-吡啶基)-5-[3-(三氟甲基)吡唑-1-基]吡唑



[1115] 2-(3-吡啶基)-5-[3-(三氟甲基)吡唑-1-基]吡唑的制备以类似于实施例55的合成来进行。此处,使用100mg (735 μ mol) 3-(三氟甲基)-1H-吡唑、242mg (882 μ mol) 5-溴-2-(3-吡啶基)吡唑(参见实施例49,步骤2)、7.1mg (37 μ mol) 碘化亚铜(I)、213mg (1.54mmol) 碳酸钾和24 μ l (0.15mmol) 反式-N,N'-二甲基环己烷-1,2-二胺。在脱气甲苯(1ml)中进行反应,反应时间为6小时。得到167mg (纯度100%,收率69%) 2-(3-吡啶基)-5-[3-(三氟甲基)吡唑-1-基]吡唑。

[1116] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, d_6 -DMSO) : δ = 9.375 (8.8) ; 9.368 (8.8) ; 9.346 (16.0) ; 8.809 (7.3) ; 8.806 (7.4) ; 8.699 (5.9) ; 8.696 (6.4) ; 8.688 (6.1) ; 8.684 (6.3) ; 8.547 (3.4) ; 8.543 (3.9) ; 8.540 (3.8) ; 8.537 (3.4) ; 8.526 (3.7) ; 8.522 (3.9) ; 8.519 (4.1) ; 8.516 (3.4) ; 8.318 (0.5) ; 8.277 (9.1) ; 8.274 (8.8) ; 7.968 (3.2) ; 7.944 (11.9) ; 7.930 (9.9) ; 7.925 (9.3) ; 7.907 (2.6) ; 7.902 (2.8) ; 7.695 (4.7) ; 7.683 (4.6) ; 7.674 (4.6) ; 7.662 (4.4) ; 7.076 (8.5) ; 7.070 (8.5) ; 3.332 (215.6) ; 2.677 (0.9) ; 2.673 (1.2) ; 2.669 (0.9) ; 2.526 (3.4) ; 2.513 (66.6) ; 2.508 (131.4) ; 2.504 (171.9) ; 2.499 (127.4) ; 2.335 (0.8) ; 2.331 (1.2) ; 2.326 (0.8) ; 1.990 (0.6) ; 0.000 (0.7) 。

[1117] 实施例57: 2,5-二(3-吡啶基)吡唑

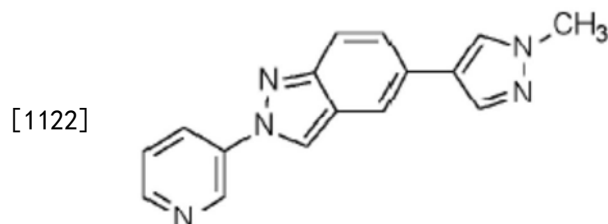


[1119] 与H.Dong等,Org.Lett.,2011,13,2726-2729的反应过程类似,在氩气下,将[1,1'-二(二苯基膦基)二茂铁]二氯化钯(II)、4.0ml 1,4-二氧杂环己烷、1.0ml水和100mg (365 μ mol) 5-溴-2-(3-吡啶基)吡唑(参见实施例49,步骤2)添加至58mg (0.47mmol) 3-吡啶基硼酸、155mg (1.46mmol) 碳酸钠和13.0mg (18 μ mol) 的混合物中。将反应混合物在80 $^{\circ}\text{C}$ 下加热2.5小时,并在冷却至室温后通过棉布过滤,然后用1M氢氧化钠水溶液制成碱性。进行相分离,并用二氯甲烷反复萃取水相。将合并的有机相用硫酸钠干燥,并在减压下除去溶剂。通过MPLC在硅胶上(梯度:乙酸乙酯/环己烷0:100 \rightarrow 100:0)对残留物进行色谱分离。得到80mg (纯度100%,收率81%) 2,5-二(3-吡啶基)吡唑。

[1120] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, d_6 -DMSO) : δ = 9.384 (9.1) ; 9.377 (9.3) ; 9.309 (16.0) ; 8.988

(8.7); 8.983 (8.9); 8.685 (5.7); 8.682 (6.6); 8.673 (6.1); 8.670 (6.6); 8.591 (5.6); 8.587 (6.3); 8.579 (6.0); 8.575 (6.2); 8.554 (3.3); 8.550 (3.9); 8.547 (4.0); 8.544 (3.5); 8.533 (3.6); 8.529 (4.0); 8.527 (4.3); 8.523 (3.6); 8.318 (0.3); 8.179 (3.3); 8.173 (4.8); 8.169 (3.6); 8.154 (15.7); 7.898 (6.3); 7.876 (8.7); 7.754 (7.1); 7.750 (7.3); 7.732 (5.3); 7.727 (5.5); 7.686 (5.1); 7.674 (5.0); 7.665 (5.0); 7.653 (4.8); 7.528 (4.8); 7.516 (4.7); 7.508 (4.6); 7.496 (4.4); 3.332 (103.5); 2.677 (0.7); 2.673 (0.9); 2.669 (0.7); 2.526 (2.4); 2.508 (102.3); 2.504 (136.8); 2.499 (104.3); 2.335 (0.6); 2.331 (0.9); 2.326 (0.7); 1.990 (0.4); 1.259 (0.4); 1.250 (0.3); 1.230 (0.5); 0.000 (5.7)。

[1121] 实施例58: 5-(1-甲基吡唑-4-基)-2-(3-吡啶基) 吲唑



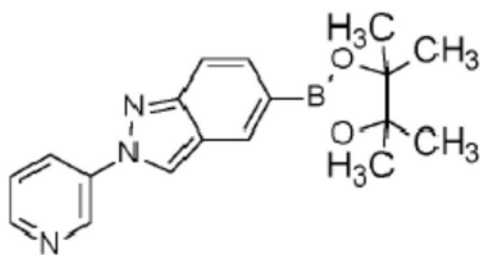
[1123] 与CH.O.Ndubaku等, J. Med. Chem., 2013, 56, 4597-4610的反应过程类似, 将1.2ml水和0.6ml乙腈添加至100mg (365 μ mol) 5-溴-2-(3-吡啶基) 吲唑 (参见实施例49, 步骤2) 和107mg (1.09mmol) 乙酸钾的混合物中。用氩气流反复吹扫反应混合物, 然后加入114mg (547 μ mol) 1-甲基-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂硼杂环戊烷-2-基)-1H-吡唑在0.6ml乙腈中的溶液, 其后加入42mg (36 μ mol) 四(三苯基膦) 钯。关闭容器, 将反应混合物在CEM Discover微波反应器中加热至120 $^{\circ}$ C, 持续60分钟。将反应混合物通过用乙酸乙酯清洗的深度过滤器过滤。用水洗涤滤液, 进行相分离并用乙酸乙酯萃取水相。将合并的有机相用硫酸钠干燥, 并在减压下除去溶剂。通过MPLC在硅胶上 (梯度: 乙酸乙酯/环己烷0:100 \rightarrow 100:0) 对残留物进行色谱分离。得到26mg (纯度100%, 收率26%) 5-(1-甲基吡唑-4-基)-2-(3-吡啶基) 吲唑。

[1124] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.349 (2.4); 9.343 (2.4); 9.149 (4.2); 9.147 (4.1); 8.656 (1.7); 8.653 (1.8); 8.645 (1.8); 8.641 (1.8); 8.511 (1.0); 8.507 (1.2); 8.504 (1.1); 8.501 (1.0); 8.490 (1.1); 8.486 (1.2); 8.483 (1.2); 8.480 (1.0); 8.199 (4.4); 7.943 (4.6); 7.942 (4.5); 7.913 (3.2); 7.757 (1.8); 7.735 (2.5); 7.664 (1.3); 7.663 (1.3); 7.652 (1.3); 7.643 (1.3); 7.631 (1.3); 7.630 (1.3); 7.618 (2.1); 7.614 (2.1); 7.596 (1.6); 7.592 (1.6); 3.885 (16.0); 3.334 (44.0); 2.526 (0.9); 2.512 (17.3); 2.508 (34.2); 2.504 (44.4); 2.499 (32.6); 2.495 (16.2); 1.232 (0.8); 0.000 (7.6)。

[1125] 实施例59: 5-(2-吡啶基)-2-(3-吡啶基) 吲唑

[1126] 步骤1: 2-(3-吡啶基)-5-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂硼杂环戊烷-2-基) 吲唑 (59a)

[1127]

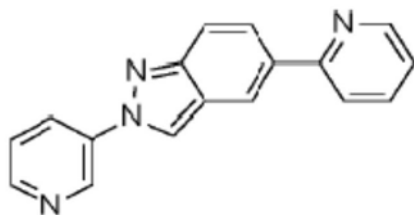


[1128] 与T.Ishiyama等, J.Org.Chem., 1995, 60, 7508-7510的反应过程类似, 在氩气下, 将脱气1,4-二氧杂环己烷(6.0ml)添加至500mg (1.82mmol) 5-溴-2-(3-吡啶基) 吡唑(参见实施例49, 步骤2)、486mg (1.92mmol) 二(频哪醇合)二硼、537mg (5.47mmol) 乙酸钾、45mg (55 μmol) [1,1'-二(二苯基膦基)二茂铁]二氯化钯(II) (与二氯甲烷的1:1加合物) 和30mg (55 μmol) 1,1'-二(二苯基膦基)二茂铁的混合物中。将反应混合物在回流下加热6小时, 并在冷却至室温后, 通过用乙酸乙酯清洗的深度过滤器进行过滤。向滤液中添加水和二氯甲烷, 进行相分离, 并用二氯甲烷萃取水相。将合并的有机相用硫酸钠干燥, 并在减压下除去溶剂。通过MPLC在硅胶上(梯度: 乙酸乙酯/环己烷0:100→50:50)对残留物进行色谱分离。得到343mg (纯度70%, 收率42%) 2-(3-吡啶基)-5-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂硼杂环戊烷-2-基) 吡唑(作为与2-(3-吡啶基) 吡唑的混合物的形式)。不经进一步纯化, 将该混合物用于后续反应。

[1129] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.349 (1.4); 9.342 (1.4); 9.287 (1.4); 9.285 (1.4); 9.216 (1.2); 9.214 (1.2); 8.678 (0.6); 8.674 (0.6); 8.666 (1.1); 8.663 (1.1); 8.655 (0.5); 8.651 (0.5); 8.523 (0.3); 8.520 (0.4); 8.517 (0.4); 8.513 (0.6); 8.510 (0.4); 8.506 (0.4); 8.503 (0.6); 8.499 (0.5); 8.496 (0.5); 8.492 (0.7); 8.489 (0.4); 8.486 (0.4); 8.217 (1.3); 7.810 (0.6); 7.789 (0.6); 7.754 (0.5); 7.752 (0.5); 7.732 (0.6); 7.730 (0.6); 7.716 (0.6); 7.694 (0.8); 7.673 (0.5); 7.669 (0.5); 7.668 (0.5); 7.661 (0.5); 7.655 (0.6); 7.654 (0.6); 7.648 (0.5); 7.640 (0.5); 7.636 (0.4); 7.559 (0.8); 7.557 (0.8); 7.537 (0.6); 7.535 (0.6); 7.354 (0.4); 7.352 (0.4); 7.349 (0.3); 7.332 (0.3); 7.330 (0.3); 7.157 (0.4); 7.155 (0.4); 7.140 (0.4); 7.139 (0.4); 7.136 (0.4); 7.134 (0.4); 3.939 (0.4); 3.336 (6.5); 2.510 (8.3); 2.505 (10.7); 2.501 (7.9); 1.397 (1.3); 1.328 (16.0); 1.072 (2.3)。

[1130] 步骤2: 5-(2-吡啶基)-2-(3-吡啶基) 吡唑

[1131]



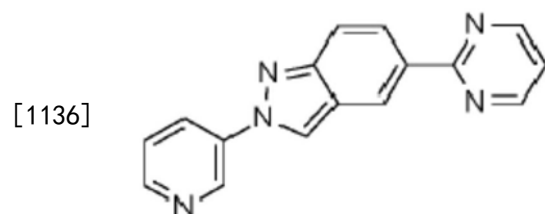
[1132] 与T.Furuya等, J. Am. Chem. Soc., 2010, 132, 3793-3807的反应过程类似, 在氩气下, 将39mg (0.28mmol) 碳酸钾、100mg (218 μmol) 2-(3-吡啶基)-5-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂硼杂环戊烷-2-基) 吡唑(纯度70%) 和11mg (9.6 μmol) 四(三苯基膦)钯添加至18 μl (0.19mmol) 2-溴吡啶在1.0ml 1,2-二甲氧基乙烷中的溶液中。将反应混合物在100℃下加热3小时, 并在冷却至室温后添加水。进行相分离, 并用乙酸乙酯萃取水相。将合并的有机相用硫酸钠干燥, 并在减压下除去溶剂。通过MPLC在硅胶上(梯度: 乙酸乙酯/环己烷0:100→

100:0)对残留物进行色谱分离。得到25mg (纯度100%,收率41%) 5-(2-吡啶基)-2-(3-吡啶基)吡唑。

[1133] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$) : δ = 9.378 (9.5) ; 9.371 (9.4) ; 9.330 (15.8) ; 9.329 (16.0) ; 8.697 (5.2) ; 8.695 (5.4) ; 8.684 (11.3) ; 8.681 (10.9) ; 8.672 (6.8) ; 8.669 (6.8) ; 8.548 (3.8) ; 8.544 (4.4) ; 8.541 (4.4) ; 8.537 (4.3) ; 8.527 (14.6) ; 8.520 (5.2) ; 8.517 (3.9) ; 8.318 (0.6) ; 8.167 (6.3) ; 8.163 (6.1) ; 8.144 (7.2) ; 8.140 (7.2) ; 8.078 (6.7) ; 8.058 (8.6) ; 7.926 (3.6) ; 7.921 (3.6) ; 7.906 (5.6) ; 7.902 (5.5) ; 7.887 (3.1) ; 7.883 (3.1) ; 7.856 (8.5) ; 7.833 (7.4) ; 7.686 (5.2) ; 7.675 (5.0) ; 7.666 (5.0) ; 7.654 (4.8) ; 7.373 (4.1) ; 7.371 (4.3) ; 7.359 (4.5) ; 7.355 (4.3) ; 7.353 (4.0) ; 7.342 (3.8) ; 7.340 (3.8) ; 3.336 (231.2) ; 2.677 (1.2) ; 2.672 (1.6) ; 2.668 (1.2) ; 2.526 (4.3) ; 2.512 (90.3) ; 2.508 (177.5) ; 2.503 (229.6) ; 2.499 (167.1) ; 2.495 (82.5) ; 2.335 (1.1) ; 2.330 (1.5) ; 2.326 (1.1) ; 2.237 (0.6) ; 0.008 (2.4) ; 0.000 (66.9) ; -0.008 (2.5) 。

[1134] 以类似的方式制备。表1和表3中所列的化合物61至73、101和104

[1135] 实施例60: 2-(3-吡啶基)-5-嘧啶-2-基-吡唑

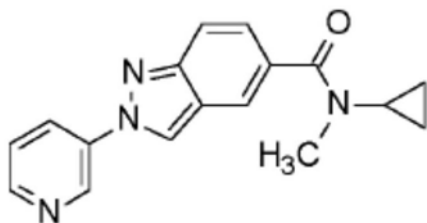


[1137] 与W0 2010/151601的反应过程类似,在氩气下,将脱气乙腈(1.0ml)和86mg (0.81mmol)碳酸钠在脱气水(1.0ml)中的溶液添加至32mg (0.20mmol) 2-溴嘧啶、109mg (238 μmol) 2-(3-吡啶基)-5-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂硼杂环戊烷-2-基)吡唑(纯度70%)和7mg (6 μmol) 四(三苯基膦)钯的混合物中。将反应混合物在73℃下加热24小时,并在冷却至室温后添加水和乙酸乙酯。进行相分离并用乙酸乙酯萃取水相。将合并的有机相用硫酸镁干燥,并在减压下除去溶剂。通过MPLC在硅胶上(梯度:乙酸乙酯/环己烷50:50→75:25)对残留物进行色谱分离。得到60mg (纯度96%,收率88%) 2-(3-吡啶基)-5-嘧啶-2-基-吡唑。

[1138] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$) : δ = 9.408 (7.7) ; 9.406 (7.6) ; 9.373 (4.0) ; 9.367 (4.0) ; 8.934 (14.4) ; 8.922 (16.0) ; 8.918 (6.0) ; 8.915 (4.4) ; 8.695 (2.8) ; 8.691 (3.0) ; 8.683 (2.9) ; 8.679 (3.0) ; 8.544 (1.8) ; 8.541 (2.1) ; 8.538 (2.0) ; 8.534 (1.8) ; 8.524 (2.0) ; 8.520 (2.1) ; 8.517 (2.2) ; 8.513 (1.9) ; 8.418 (3.6) ; 8.414 (3.5) ; 8.395 (3.9) ; 8.391 (3.9) ; 7.871 (4.3) ; 7.848 (4.0) ; 7.694 (2.3) ; 7.693 (2.3) ; 7.682 (2.3) ; 7.681 (2.3) ; 7.673 (2.3) ; 7.672 (2.3) ; 7.661 (2.2) ; 7.660 (2.2) ; 7.456 (3.9) ; 7.443 (7.3) ; 7.431 (3.8) ; 5.761 (0.7) ; 3.340 (50.8) ; 2.529 (0.6) ; 2.524 (0.9) ; 2.516 (14.0) ; 2.511 (28.9) ; 2.507 (38.4) ; 2.502 (27.9) ; 2.498 (13.6) ; 0.000 (5.9) 。

[1139] 实施例75: N-环丙基-N-甲基-2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑-5-羧酰胺

[1140]

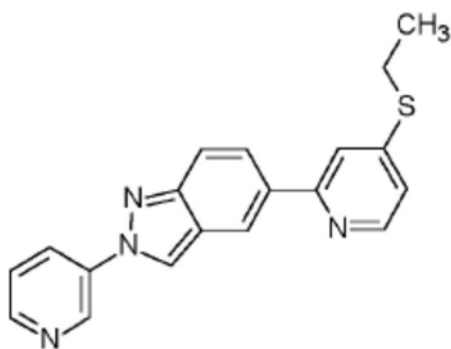


[1141] 在室温下,将57mg (0.24mmol) 2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-羧酸、17mg (0.24mmol) N-甲基环丙胺、55mg (0.29mmol) 1-乙基-3-(3-二甲基氨基丙基) 碳二亚胺和3.2mg (24 μ mol) 1-羟基-1H-苯并三唑在3ml吡啶中的溶液搅拌4小时。将反应混合物用水和乙酸乙酯稀释。进行相分离,然后用乙酸乙酯萃取水相三次。将合并的有机相用硫酸钠干燥并过滤,在减压下除去溶剂。通过MPLC在硅胶上(梯度:乙酸乙酯/环己烷0:100 \rightarrow 100:0)对残留物进行色谱分离。得到30mg (纯度100%,收率43%) N-环丙基-N-甲基-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-羧酰胺。

[1142] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ =9.350 (3.2); 9.343 (3.3); 9.287 (5.6); 9.285 (5.5); 8.681 (2.1); 8.677 (2.3); 8.669 (2.3); 8.666 (2.3); 8.522 (1.2); 8.518 (1.4); 8.515 (1.4); 8.512 (1.3); 8.501 (1.3); 8.497 (1.4); 8.495 (1.5); 8.491 (1.3); 7.978 (3.7); 7.761 (2.5); 7.738 (2.9); 7.677 (1.8); 7.665 (1.7); 7.656 (1.7); 7.644 (1.7); 7.468 (2.0); 7.465 (2.0); 7.446 (1.7); 7.442 (1.8); 5.755 (3.4); 3.319 (22.1); 3.008 (16.0); 2.987 (1.3); 2.978 (0.9); 2.970 (0.7); 2.960 (0.4); 2.672 (0.4); 2.525 (0.7); 2.511 (19.0); 2.507 (38.5); 2.503 (51.1); 2.498 (37.7); 2.494 (18.9); 0.561 (1.8); 0.547 (1.8); 0.458 (2.1); 0.008 (0.8); 0.000 (23.7); -0.008 (1.0) ppm。

[1143] 实施例76: 5-[4-(乙基硫烷基)吡啶-2-基]-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑

[1144]



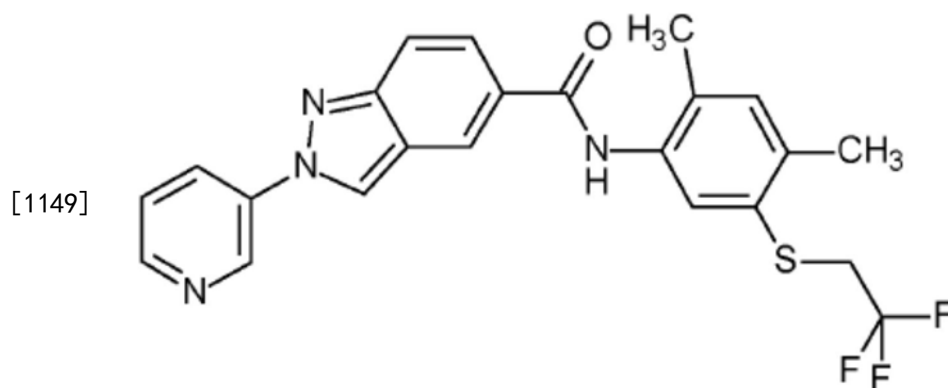
[1145] 将93mg (0.89mmol) 乙硫醇钠添加至27mg (89 μ mol) 5-(4-氯吡啶-2-基)-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑在4ml无水二甲基甲酰胺中的溶液中。将反应混合物在室温下搅拌过夜,然后在减压下除去溶剂。将残留物溶解在乙酸乙酯和水中,进行相分离,并用乙酸乙酯萃取水相三次。将合并的有机相用硫酸钠干燥并过滤,在减压下除去溶剂。通过MPLC在硅胶上(梯度:乙酸乙酯/环己烷0:100 \rightarrow 50:0)对残留物进行色谱分离。得到11mg (纯度100%,收率38%) 5-[4-(乙基硫烷基)吡啶-2-基]-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑。

[1146] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ =9.375 (4.2); 9.369 (4.3); 9.309 (7.2); 8.683 (2.9); 8.680 (3.1); 8.672 (3.1); 8.669 (3.1); 8.545 (6.4); 8.534 (1.8); 8.523 (1.9); 8.519 (2.0); 8.516 (2.1); 8.513 (1.7); 8.486 (4.3); 8.473 (4.4); 8.150 (2.8); 8.146 (2.7); 8.127 (3.2); 8.123 (3.1); 7.852 (5.0); 7.850 (5.1); 7.837 (4.0); 7.814

(3.4); 7.685 (2.3); 7.673 (2.2); 7.664 (2.2); 7.652 (2.1); 7.236 (3.1); 7.232 (3.1); 7.223 (3.1); 7.219 (3.0); 3.318 (62.4); 3.232 (2.2); 3.214 (6.9); 3.195 (7.1); 3.177 (2.3); 2.676 (0.6); 2.671 (0.8); 2.667 (0.6); 2.507 (87.7); 2.502 (113.3); 2.498 (84.3); 2.333 (0.6); 2.329 (0.7); 2.325 (0.5); 1.363 (7.6); 1.345 (16.0); 1.327 (7.4); 1.259 (0.4); 1.250 (0.7); 1.230 (0.6); 0.000 (2.0) ppm。

[1147] 以类似的方式制备表1和表3中所列的化合物77至80。

[1148] 实施例81: N-{2,4-二甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)硫烷基]苯基}-2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑-5-羧酰胺



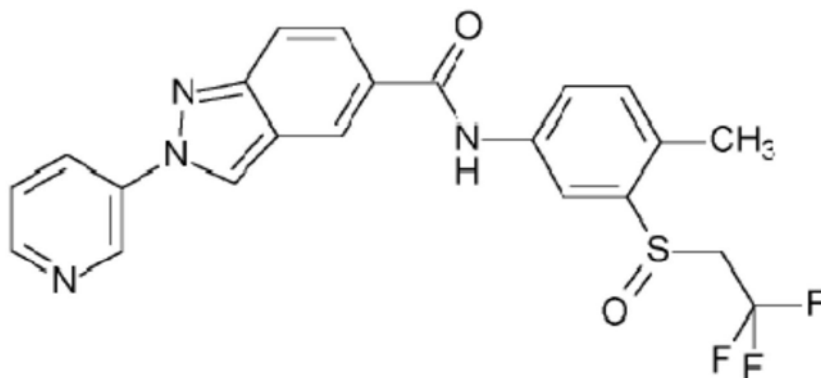
[1150] 在氩气气氛下,将0.53ml 2M(1.07mmol)三甲基铝在甲苯中的溶液缓慢滴加至251mg(1.07mmol)2,4-二甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)硫烷基]苯胺在5ml 1,2-二氯乙烷中的溶液中。将溶液在室温下搅拌30分钟,加入200mg(0.71mmol)2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑-5-羧酸甲酯,然后将混合物在100℃下搅拌过夜。冷却至室温后,向反应混合物中小心添加饱和酒石酸钾钠溶液,然后用二氯甲烷反复萃取混合物。将合并的有机相用硫酸钠干燥并过滤,并在减压下除去溶剂。通过MPLC在硅胶上(梯度:乙酸乙酯/环己烷0:100→100:0)对残留物进行色谱分离。得到102mg(纯度90%,收率28%)N-{2,4-二甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)硫烷基]苯基}-2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑-5-羧酰胺。

[1151] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ =9.967 (3.6); 9.462 (5.6); 9.448 (0.4); 9.390 (3.2); 9.384 (3.3); 8.702 (2.3); 8.699 (2.5); 8.690 (2.4); 8.687 (2.5); 8.557 (5.0); 8.539 (1.5); 8.536 (1.8); 8.533 (1.9); 8.529 (1.5); 7.921 (1.4); 7.918 (1.3); 7.899 (2.6); 7.895 (2.6); 7.851 (3.5); 7.828 (1.8); 7.698 (1.8); 7.686 (1.8); 7.678 (1.8); 7.666 (1.7); 7.571 (5.2); 7.208 (4.7); 4.038 (0.4); 4.021 (0.4); 3.892 (1.1); 3.866 (3.5); 3.840 (3.6); 3.814 (1.2); 3.317 (32.3); 2.675 (0.4); 2.671 (0.5); 2.666 (0.4); 2.524 (1.5); 2.510 (31.3); 2.506 (61.7); 2.502 (81.3); 2.497 (60.7); 2.493 (30.4); 2.385 (14.2); 2.333 (0.5); 2.329 (0.6); 2.324 (0.5); 2.226 (16.0); 2.204 (1.4); 2.185 (0.9); 1.988 (1.9); 1.193 (0.5); 1.175 (1.0); 1.158 (0.5); 0.008 (1.4); 0.000 (38.9); -0.008 (1.4) ppm。

[1152] 以类似的方式制备表1和表3中所列的化合物82至93。

[1153] 实施例94: N-{4-甲基-3-[(2,2,2-三氟乙基)亚磺酰基]苯基}-2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑-5-羧酰胺

[1154]



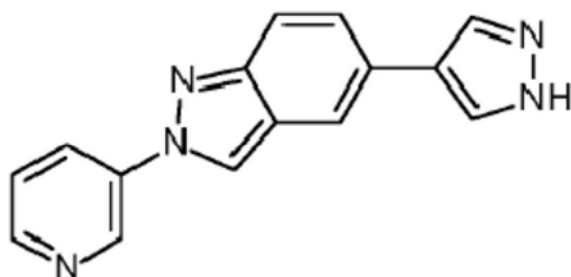
[1155] 将催化量的钨酸钠添加至50mg (0.11mmol) N-{4-甲基-3-[(2,2,2-三氟乙基)硫烷基]苯基}-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-羧酰胺在2.5ml乙酸中的溶液中,并在0℃下加入98μl (0.11mmol) 浓度为3.5%的过氧化氢溶液。将反应混合物在0℃下搅拌1小时并在室温下搅拌过夜。然后加入4μl (44μmol) 浓度为35%的过氧化氢溶液,并将混合物在室温下再搅拌一夜。用水和二氯甲烷稀释反应混合物。将有机相分离出并依次用水和亚硫酸氢钠浓溶液洗涤。然后,将有机相用硫酸钠干燥并过滤,在减压下除去溶剂。通过MPLC在硅胶上(梯度:乙酸乙酯/环己烷20:80→100:0)对残留物进行色谱分离。得到19.8mg (纯度95%,收率37%) N-{4-甲基-3-[(2,2,2-三氟乙基)亚磺酰基]苯基}-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-羧酰胺。

[1156] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 10.618 (4.2); 9.478 (6.2); 9.394 (3.7); 9.387 (3.8); 8.706 (2.5); 8.703 (2.8); 8.695 (2.7); 8.691 (2.9); 8.600 (4.5); 8.563 (1.4); 8.560 (1.7); 8.557 (1.6); 8.553 (1.5); 8.543 (1.6); 8.539 (1.7); 8.536 (1.8); 8.532 (1.5); 8.373 (3.9); 8.368 (4.2); 8.314 (0.3); 8.000 (1.9); 7.995 (1.9); 7.980 (2.1); 7.974 (2.1); 7.940 (1.7); 7.936 (1.8); 7.917 (3.3); 7.913 (3.5); 7.869 (4.0); 7.847 (2.1); 7.703 (2.0); 7.691 (1.9); 7.682 (1.9); 7.670 (1.9); 7.367 (3.0); 7.346 (2.8); 4.181 (1.0); 4.171 (0.5); 4.153 (1.1); 4.143 (1.3); 4.126 (0.5); 4.116 (1.3); 4.089 (0.4); 3.949 (0.3); 3.922 (1.2); 3.913 (0.4); 3.895 (1.4); 3.885 (1.1); 3.868 (0.5); 3.858 (1.0); 3.832 (0.3); 3.318 (50.7); 2.791 (0.6); 2.676 (0.6); 2.671 (0.8); 2.667 (0.6); 2.635 (0.5); 2.524 (2.4); 2.511 (44.9); 2.507 (91.6); 2.502 (122.3); 2.497 (92.4); 2.493 (47.8); 2.351 (16.0); 2.333 (0.9); 2.329 (1.0); 2.324 (0.8); 1.336 (0.7); 1.299 (0.5); 1.259 (0.8); 1.250 (1.0); 1.234 (0.5); 0.146 (0.6); 0.008 (5.1); 0.000 (138.3); -0.008 (6.3); -0.150 (0.6) ppm。

[1157] 以类似的方式制备表1和表3中所列的化合物95至97。

[1158] 实施例98: 5-(1H-吡唑-4-基)-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑

[1159]

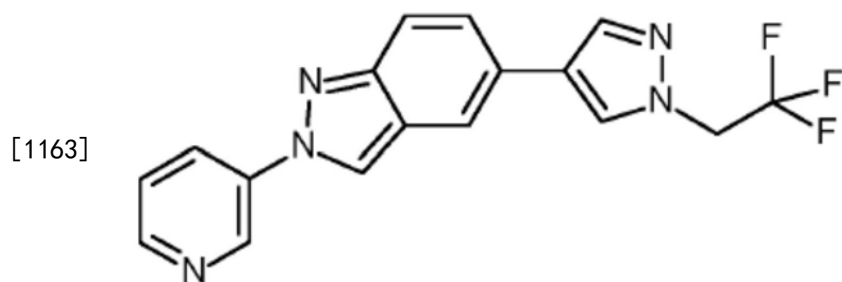


[1160] 首先,将在15ml N,N-二甲基甲酰胺和8.25ml水中的1.06g (5.47mmol) 5-(4,4,5,

5-四甲基-1,3,2-二氧杂硼杂环戊烷-2-基)-1H-吡唑装入50ml圆底烧瓶中。将该烧瓶用氩气吹扫并且保持在氩气流下,同时加入1.74g (16.42mmol) 碳酸钠、1.50g (5.47mmol) 5-溴-2-(3-吡啶基) 吡唑和0.31g (0.27mmol) 四(三苯基膦) 钯。然后,将反应混合物在120℃的油浴上搅拌约18小时。冷却后,过滤反应混合物并用乙酸乙酯清洗过滤器。用水反复洗涤滤液。将有机相分离出并用水洗涤。将合并的有机相经干燥的硫酸钠干燥、过滤并在减压下除去溶剂。为进行进一步纯化,将残留物在二氯甲烷中进行初始溶解,并通过过滤与不溶成分分离。将滤液与水进行搅拌,将不溶部分滤出并在减压下干燥。得到505mg (纯度100% (LC/MS), 收率35%) 题述化合物。

[1161] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, d_6 -DMSO): δ = 12.941 (2.9); 9.350 (9.6); 9.344 (9.6); 9.136 (16.0); 8.655 (6.5); 8.652 (7.1); 8.643 (6.8); 8.640 (7.0); 8.510 (3.7); 8.507 (4.5); 8.505 (4.5); 8.501 (3.8); 8.490 (4.0); 8.486 (4.6); 8.484 (4.8); 8.480 (3.8); 8.314 (0.7); 8.257 (4.7); 8.007 (4.6); 7.951 (12.7); 7.755 (5.7); 7.732 (9.9); 7.676 (8.2); 7.673 (8.3); 7.662 (5.6); 7.650 (9.7); 7.641 (5.2); 7.629 (4.7); 3.321 (105.7); 2.891 (0.4); 2.732 (0.4); 2.672 (1.3); 2.507 (159.7); 2.503 (205.5); 2.498 (160.5); 2.329 (1.3); 0.000 (5.4) ppm。

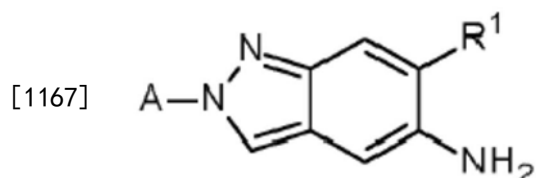
[1162] 实施例99: 2-(吡啶-3-基)-5-[1-(2,2,2-三氟乙基)-1H-吡唑-4-基]-2H-吡唑



[1164] 首先,将100mg (0.38mmol) 5-(1H-吡唑-4-基)-2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑加入2ml无水N,N-二甲基甲酰胺中。加入79mg (0.57mmol) 碳酸钾,将烧瓶保持在氩气流下,并加入83 μ l (133mg, 0.57mmol) 三氟甲烷磺酸2,2,2-三氟乙酯。然后,将反应混合物在室温下搅拌过夜。通过薄层色谱法和LC/MS监测反应过程。加入28 μ l (0.11mmol) 三氟甲烷磺酸三氟乙酯后,将反应混合物在室温下搅拌经过周末。用水反复洗涤滤液,并将合并的有机相经干燥的硫酸钠干燥、过滤并在减压下除去溶剂。为进一步纯化,将残留物在二氯甲烷中进行初始溶解,并通过过滤与不溶成分分离。将滤液与水搅拌,所得固体通过过滤分离。得到505mg (纯度100% (LC/MS), 收率35%) 题述化合物。

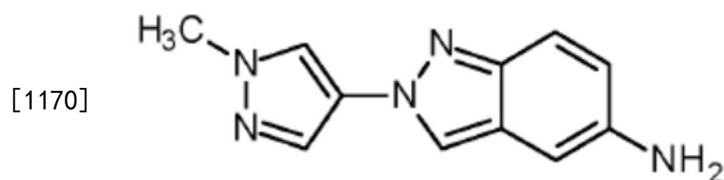
[1165] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.356 (8.4); 9.350 (8.8); 9.175 (14.9); 8.661 (6.6); 8.649 (6.7); 8.513 (4.1); 8.492 (4.4); 8.349 (15.0); 8.139 (16.0); 7.998 (11.7); 7.786 (6.0); 7.763 (8.2); 7.667 (4.5); 7.655 (4.9); 7.646 (11.1); 7.635 (4.8); 7.623 (5.3); 5.206 (2.9); 5.183 (9.2); 5.160 (9.6); 5.137 (3.3); 3.323 (45.8); 2.673 (0.7); 2.504 (114.3); 2.330 (0.7); 1.990 (0.9); 1.176 (0.5); 0.146 (0.6); 0.000 (109.6); -0.150 (0.6) ppm。

[1166] 式(I, $\text{R}^2=\text{NH}_2$) 的2-(杂芳基)-2H-吡唑-5-胺的通用合成



[1168] 在保护气体(氩气)气氛下,将式(I; $R^2=COOH$)的4-取代的2-(杂芳基)吡唑-5-羧酸溶解在无水1,4-二氧杂环己烷(4ml/mmol)中,然后添加1.5当量的二苯基磷酰基叠氮化物(DPPA)和1.5当量的三乙胺。然后,将反应混合物在室温下搅拌3小时。添加1M盐酸(4ml/mmol)后,将反应混合物在100℃下搅拌30分钟。冷却至室温后,通过添加碳酸钠溶液将pH调节至7,并用二氯甲烷(3×4 ml/mmol)萃取反应混合物。将有机相经硫酸镁干燥并在减压下浓缩。通过硅胶柱纯化剩余的粗产物;使用的流动相为:甲醇在二氯甲烷中的梯度为0%至5%。

[1169] 式(I, A=1-甲基-1H-吡唑-4-基; $R^1=H, R^2=NH_2$)的2-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)-2H-吡唑-5-胺

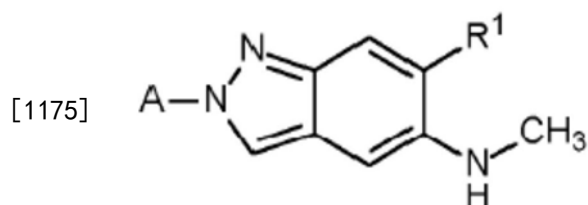


[1171] 该化合物例如由2.87g(11.8mmol)2-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)-2H-吡唑-5-羧酸根据所述通用合成制备。得到2.06g(收率为理论值的81%;根据HPLC-MS的纯度为98%)题述化合物。

[1172] APCI MS, $m/z=214 [M+H]^+$

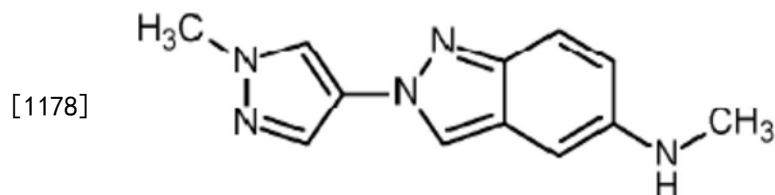
[1173] 式(I, $R^2=NHCH_3$)的N-甲基-2-(杂芳基)-2H-吡唑-5-胺的通用合成

[1174] 方法A:



[1176] 将甲醇钠溶液(由5当量的钠和甲醇(5ml/mmol)制备)添加至由相应的式(I, $R^2=NH_2$)的2-(杂芳基)-2H-吡唑-5-胺和5当量的多聚甲醛在甲醇中(50ml/mmol)形成的悬浮液中。然后,将反应混合物在回流温度下搅拌1小时,并加入5当量的硼氢化钠。然后将反应混合物再搅拌30分钟并冷却至室温。添加1M氢氧化钠溶液(50ml/mmol),并用二氯甲烷(3×50 ml/mmol)萃取反应混合物。将合并的有机相经硫酸镁干燥、过滤并在减压下浓缩。

[1177] 式(I, A=1-甲基-1H-吡唑-4-基; $R^1=H, R^2=NH_2$)的N-甲基-2-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)-2H-吡唑-5-胺



[1179] 该化合物例如由9.90g (4.6mmol) 2-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)-2H-吡唑-5-胺根据所述通用合成制备。得到1.20g (收率为理论值的100%;根据HPLC-MS的纯度为99%) 题述化合物。

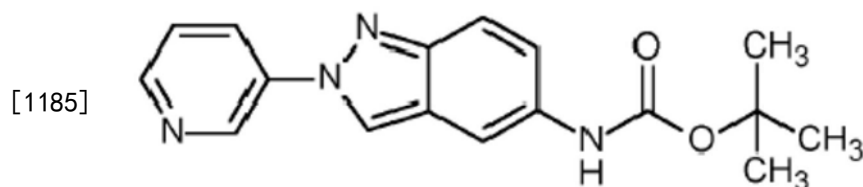
[1180] APCI MS, $m/z = 228 [M+H]^+$

[1181] 方法B:

[1182] 步骤1:

[1183] 在保护气体(氩气)气氛下,将5-溴-2-(杂芳基)-2H-吡唑(参见化合物49,步骤2)溶解在无水1,4-二氧杂环己烷(3ml/mmol)中,然后添加1.2当量的氨基甲酸叔丁酯、2当量的碳酸铯、0.05当量的三(二亚苄基丙酮)二钨和0.1当量的Xantphos。将反应混合物在回流温度下搅拌6小时,然后冷却至室温。然后添加水(3ml/mmol),并用乙酸乙酯($3 \times 3\text{ml}/\text{mmol}$)萃取反应混合物。将有机相经硫酸镁干燥、过滤并在减压下浓缩。通过硅胶柱纯化剩余的粗产物;使用的流动相为:甲醇在二氯甲烷中的梯度为0%至7%。

[1184] 式(I-f, A=吡啶-3-基; $R^1 = H$, $R^2 = NH-CO-C(CH_3)_3$)的(2-(2-吡啶-3-基)-2H-吡唑-5-基)氨基甲酸叔丁酯



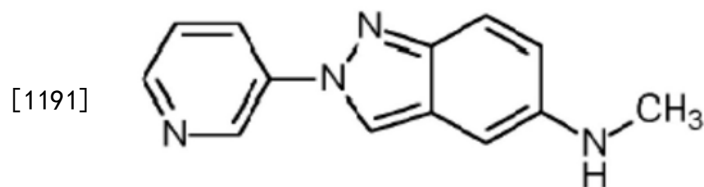
[1186] 该化合物例如由2.47g (9mmol) 5-溴-2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑根据所述通用合成制备。得到1.67g (收率为理论值的60%;根据HPLC-MS的纯度为98%) 题述化合物。

[1187] APCI MS, $m/z = 311 [M+H]^+$

[1188] 步骤2:

[1189] 在保护气体(氩气)气氛下,将(2-(杂芳基)-2H-吡唑-5-基)氨基甲酸叔丁酯溶解在无水四氢呋喃(20ml/mmol)中,然后每次少许地添加2.5当量的氢化铝锂。然后,将反应混合物在回流温度下搅拌10小时,另外添加1当量的氢化铝锂,并将混合物在回流温度下再搅拌20小时。然后,添加1M氢氧化钠水溶液(1ml/mmol)并过滤混合物。在减压下浓缩滤液,并将剩余的残留物溶解在二氯甲烷(10ml/mmol)中。将所得溶液用碳酸钠水溶液(10ml/mmol)洗涤、经硫酸镁干燥、过滤并在减压下浓缩。通过硅胶柱纯化剩余的粗产物;使用的流动相为:甲醇在二氯甲烷中的梯度为0%至5%。

[1190] 式(I, A=吡啶-3-基; $R^1 = H$, $R^2 = NH_2$)的N-甲基-(2-吡啶-3-基)-2H-吡唑-5-胺

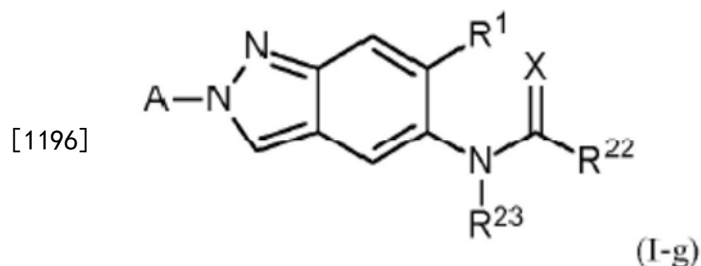


[1192] 该化合物例如由1.67g (5.4mmol) (2-(2-吡啶-3-基)-2H-吡唑-5-基)氨基甲酸叔丁酯根据所述通用合成制备。得到686mg (收率为理论值的57%;根据HPLC-MS的纯度为93%) 题述化合物。

[1193] APCI MS, $m/z = 225 [M+H]^+$

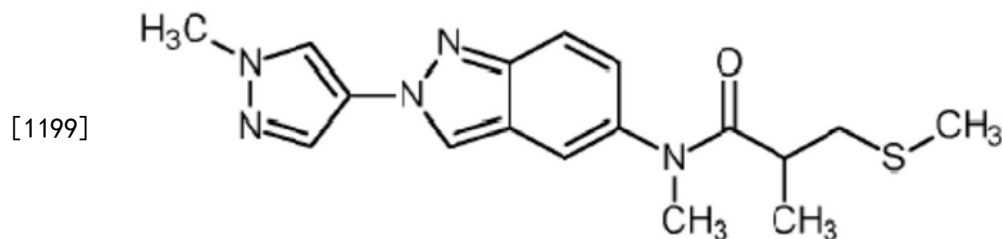
[1194] 式(I-g)的化合物的通用合成

[1195] 方法A:



[1197] 将式(I, A=杂芳基; $R^1=H$, $R^2=NH-CH_3$)的相应的N-甲基-2-(杂芳基)-2H-吡唑-5-胺溶解在无水二氯甲烷(5ml/mmol)中,并在0℃和搅拌下添加1.2当量合适的酸、2.4当量的二异丙基乙胺(Hünig碱)和1.5当量的丙基磷酸酐(T3P)在四氢呋喃中的50%浓度溶液。然后,将反应混合物在0℃下再搅拌30分钟,并随后在室温下搅拌20小时。反应结束后,将反应混合物溶解在二氯甲烷(5ml/mmol)中,并首先用碳酸钾水溶液(5ml/mmol)洗涤,然后用水(5ml/mmol)洗涤。将有机相经硫酸镁干燥、过滤并在减压下浓缩。通过硅胶柱纯化剩余的粗产物;使用的流动相为:甲醇在二氯甲烷中的梯度为0%至5%。

[1198] 实施例105:N,2-二甲基-N-(2-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)-2H-吡唑-5-基)-3-(甲硫基)丙酰胺



[1200] 该化合物例如由300mg (1.3mmol) 2-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)-2H-吡唑-5-胺根据所述通用合成制备。得到389mg (收率为理论值的86%;根据HPLC-MS的纯度为98%) 题述化合物。

[1201] APCI MS, $m/z=344 [M+H]^+$

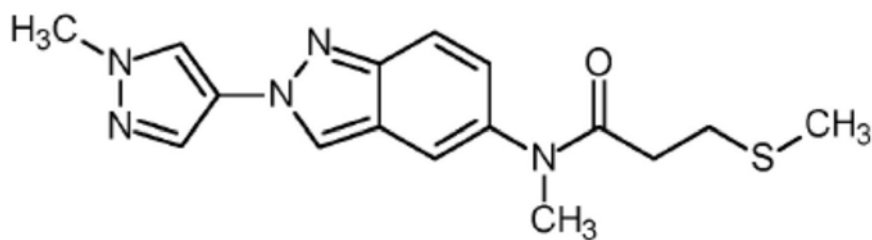
[1202] 1H NMR (300MHz, DMSO- d_6) $\delta=0.99$ (3H, d, $J=6.4$ Hz), 1.79 (3H, s), 2.30 (1H, dd, $J_1=11.8$ Hz, $J_2=4.9$ Hz), $2.57-2.77$ (2H, m), 3.21 (3H, s), 3.93 (3H, s), 7.22 (1H, dd, $J_1=9.0$ Hz, $J_2=1.7$ Hz), $7.71-7.81$ (2H, m), 8.08 (1H, s), 8.43 (1H, s), 8.86 (1H, s) ppm。

[1203] 方法B:

[1204] 在0℃下,将1.2当量的吡啶添加至在无水二氯甲烷(10ml/mmol)中的相应的式(I, A=杂芳基; $R^1=H$, $R^2=NH-CH_3$)的N-甲基-2-(杂芳基)-2H-吡唑-5-胺中。然后,滴加1.1当量合适的酰氯,并将反应混合物在室温下搅拌2小时。然后用水(2×5 ml/mmol)洗涤反应混合物。将有机相通过硫酸镁干燥、过滤并在减压下浓缩。通过HPLC纯化剩余的粗产物。

[1205] 实施例106:N-甲基-N-(2-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)-2H-吡唑-5-基)-3-(甲硫基)丙酰胺

[1206]



[1207] 该化合物例如由300mg (1.3mmol) 2-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)-2H-咪唑-5-胺根据所述通用合成制备。得到452mg (收率为理论值的100%;根据HPLC-MS的纯度为97%) 题述化合物。

[1208] APCI MS, $m/z = 330 [M+H]^+$

[1209] ^1H NMR (300MHz, DMSO- d_6) $\delta = 1.88$ (3H, s), 2.34 (2H, t, $J = 7.1\text{Hz}$), 2.62 (2H, t, $J = 7.1\text{Hz}$), 3.20 (3H, s), 3.93 (3H, s), 7.21 (1H, dd, $J_1 = 8.9\text{Hz}$, $J_2 = 1.5\text{Hz}$), 7.70-7.79 (2H, m), 8.08 (1H, s), 8.44 (1H, s), 8.85 (1H, s)。

[1210] 以类似的方式制备表1和表2中所列的化合物107至113。

[1211] 方法C:

[1212] 将相应的式(I, A=杂芳基; $R^1 = \text{H}$, $R^2 = \text{NH-CH}_3$) 的N-甲基-2-(杂芳基)-2H-咪唑-5-胺搅拌加入N,N-二甲基甲酰胺(3ml/mmol)中,并加入1.0当量合适的羧酸、1.1当量的1-羟基苯并三唑(HOBt)、1.1当量的二异丙基乙胺(Hünig碱)和1.1当量的1-乙基-3-(3-二甲基氨基丙基)碳二亚胺(EDCI),并将混合物在60°C下搅拌8小时。然后,将反应混合物溶解在二氯甲烷(5ml/mmol)中并用水($3 \times 5\text{ml}/\text{mmol}$)洗涤。将有机相通过硫酸镁干燥、过滤并在减压下浓缩。通过HPLC纯化剩余的粗产物。

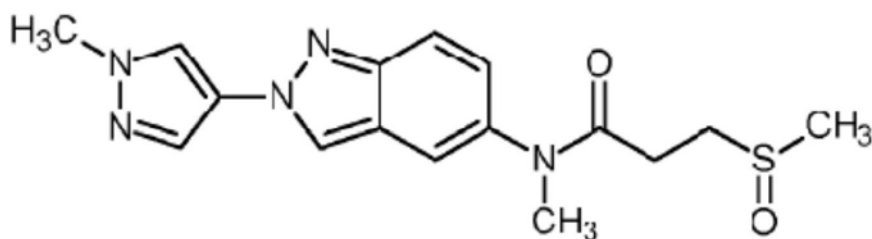
[1213] 以类似的方式制备表1和表2中所列的化合物114至118。

[1214] 通用的磺酰基氧化方法

[1215] 将0.9当量的过硼酸钠水合物($\text{NaBO}_3 \cdot 4\text{H}_2\text{O}$)添加至相应的酰胺在冰醋酸(5ml/mmol)中的溶液中,并将反应混合物在60°C下搅拌1小时。然后,添加饱和碳酸氢钠溶液直至气体释放停止。然后用乙酸乙酯($3 \times 5\text{ml}/\text{mmol}$)萃取反应混合物。将有机相通过硫酸镁干燥、过滤并在减压下浓缩。通过硅胶柱纯化剩余的粗产物;使用的流动相为:甲醇在二氯甲烷中的梯度为0%至5%。

[1216] 实施例119:N-甲基-N-(2-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)-2H-咪唑-5-基)-3-(甲基亚磺酰基)丙酰胺

[1217]



[1218] 该化合物例如由80mg (0.24mmol) N-甲基-N-(2-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)-2H-咪唑-5-基)-3-(甲磺基)丙酰胺根据所述通用合成制备。得到71mg (收率为理论值的85%;根据HPLC-MS的纯度为86%) 题述化合物。

[1219] APCI MS, $m/z = 346 [M+H]^+$

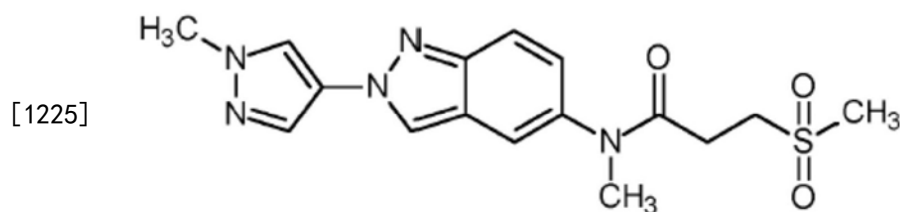
[1220] ^1H NMR (300MHz, DMSO- d_6) δ = 2.55 (3H, s), 2.59–2.72 (2H, m), 2.79–2.90 (1H, m), 3.05–3.18 (1H, m), 3.33 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.10 (1H, dd, J_1 = 9.0Hz, J_2 = 1.9Hz), 7.54 (1H, d, J = 1.3Hz), 7.80 (1H, d, J = 9.0Hz), 7.89 (1H, s), 7.94 (1H, s), 8.22 (1H, s) ppm。

[1221] 以类似的方式制备表1和表2中所列的化合物120至124。

[1222] 通用的磺酰基氧化方法

[1223] 将2.2当量的过硼酸钠水合物 ($\text{NaBO}_3 \cdot 4\text{H}_2\text{O}$) 添加至相应的酰胺在冰醋酸 (5ml/mmol) 中的溶液中, 并将反应混合物在60℃下搅拌1小时。然后, 添加饱和碳酸氢钠溶液直至气体释放停止。然后用乙酸乙酯 ($3 \times 5\text{ml/mmol}$) 萃取反应混合物。将有机相通过硫酸镁干燥、过滤并在减压下浓缩。通过硅胶柱纯化剩余的粗产物; 使用的流动相为: 甲醇在二氯甲烷中的梯度为0%至5%。

[1224] 实施例125: N-甲基-N-(2-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)-2H-吡唑-5-基)-3-(甲基磺酰基)丙酰胺



[1226] 该化合物例如由80mg (0.24mmol) N-甲基-N-(2-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)-2H-吡唑-5-基)-3-(甲磺基)丙酰胺根据所述通用合成制备。得到60mg (收率为理论值的68%; 根据HPLC-MS的纯度为97%) 目标化合物。

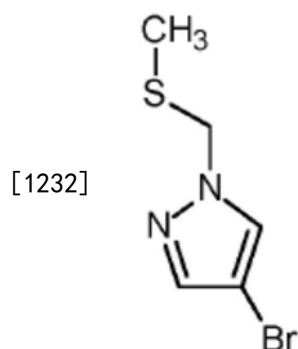
[1227] APCI MS, m/z = 362 $[\text{M}+\text{H}]^+$

[1228] ^1H NMR (300MHz, DMSO- d_6) δ = 2.70 (2H, t, J = 7.2Hz), 2.94 (3H, s), 3.35 (3H, s), 3.40 (2H, t, J = 7.2Hz), 4.03 (3H, s), 7.12 (1H, dd, J_1 = 9.0Hz, J_2 = 1.6Hz), 7.57 (1H, s), 7.83 (1H, d, J = 8.8Hz), 7.92 (1H, s), 7.97 (1H, s), 8.25 (1H, s) ppm。

[1229] 以类似的方式制备表1和表2中所列的化合物126至130。

[1230] 中间体的合成:

[1231] 4-溴-1-[(甲基硫烷基)甲基]-1H-吡唑

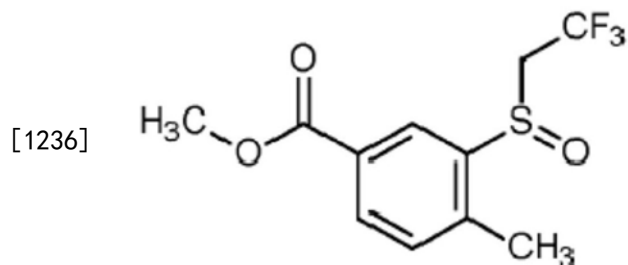


[1233] 在0℃下, 将41mg (1.02mmol) 氢化钠以每次少许的方式添加至100mg (0.68mmol) 4-溴-1H-吡唑在无水二甲基甲酰胺中的溶液中。将反应混合物在室温下搅拌15分钟, 添加0.11ml (1.4mmol) 氯二甲基硫醚, 并将混合物在室温下搅拌过夜。然后添加水, 并用乙酸乙酯反复萃取混合物。将合并的有机相用硫酸钠干燥并过滤, 在减压下除去溶剂。得到100mg

(纯度93%,收率66%) 4-溴-1-[(甲基硫烷基)甲基]-1H-吡唑。

[1234] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta=8.069$ (4.4); 7.591 (3.9); 5.242 (10.2); 3.319 (8.9); 2.502 (15.8); 2.157 (0.5); 2.121 (16.0); 2.029 (0.4); 2.024 (0.5); 1.236 (0.4); 0.002 (7.1); 0.000 (10.0)

[1235] 4-甲基-3-((2,2,2-三氟乙基)亚磺酰基)苯甲酸甲酯



[1237] 步骤1:合成4-甲基-3-((2,2,2-三氟乙基)硫代)苯甲酸甲酯

[1238] 将1.07g (7.8mmol) 碳酸钾和5.61 μl (1.1mmol) 2,2,2-三氟乙基碘加入943mg (5.17mmol) 3-巯基-4-甲基苯甲酸甲酯(参见W0 2010/094695 A1中的制备)在15ml DMF中的溶液中。然后将反应混合物在室温下搅拌20小时。然后,将反应混合物用50ml水稀释,并用50ml二氟甲烷萃取两次。将合并的有机相用硫酸镁干燥并过滤,在减压下除去溶剂。通过快速色谱法纯化剩余的粗产物;使用的流动相为:乙酸乙酯在正庚烷中的梯度为0%至10%。得到990mg (纯度93%,收率72%) 4-甲基-3-((2,2,2-三氟乙基)硫代)苯甲酸甲酯。

[1239] APCI MS, $m/z=265$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

[1240] 步骤2:

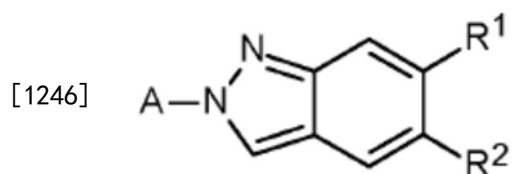
[1241] 将559mg (3.6mmol; 1.0当量) 过硼酸钠水合物 ($\text{NaBO}_3 \cdot 4\text{H}_2\text{O}$) 添加至960mg (3.6mmol) 4-甲基-3-((2,2,2-三氟乙基)硫代)苯甲酸甲酯的27ml的溶液中,并将反应混合物在60 $^{\circ}\text{C}$ 下搅拌1小时。然后,添加饱和碳酸氢钠溶液直至停止气体释放。然后用乙酸乙酯 ($3 \times 30\text{ml}$ /mmol) 萃取反应混合物。将有机相通过硫酸镁干燥、过滤并在减压下浓缩。得到1.08g (纯度96%;收率100%) 的4-甲基-3-((2,2,2-三氟乙基)亚磺酰基)苯甲酸甲酯。

[1242] APCI MS, $m/z=281$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

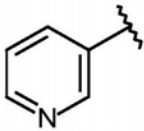
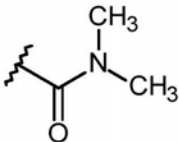
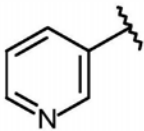
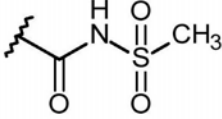
[1243] 式(I)的化合物以及未包括在式(I)中的那些化合物列于下表中。未包括在式(I)中的那些化合物也构成本发明的主题的一部分。

[1244] 表1

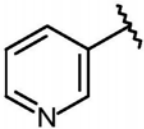
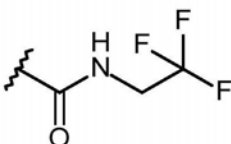
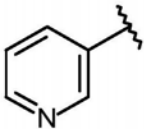
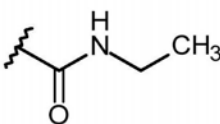
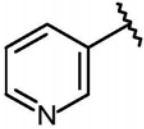
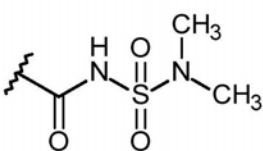
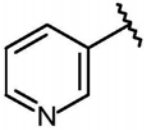
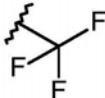
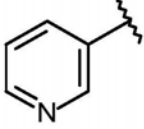
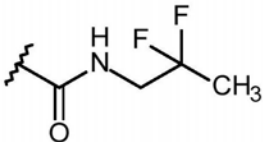
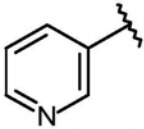
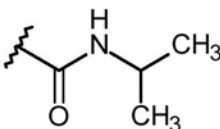
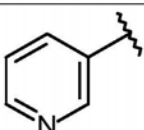
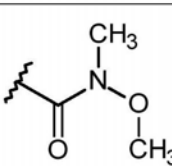
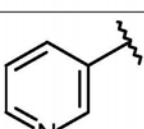
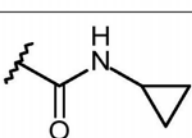
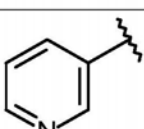
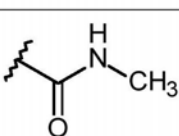
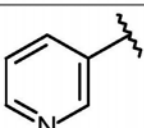
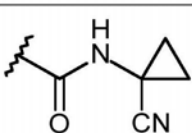
[1245] 下式的化合物



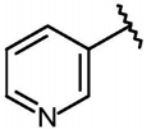
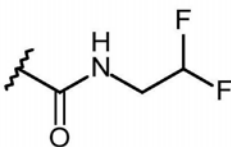
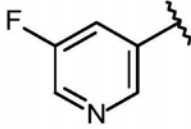
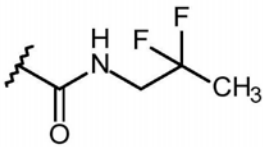
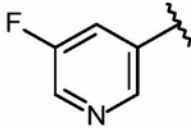
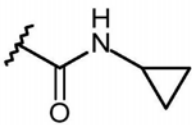
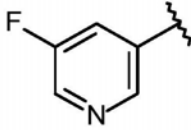
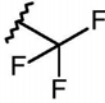
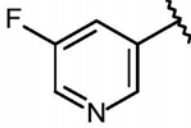
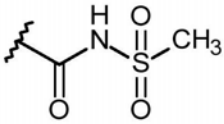
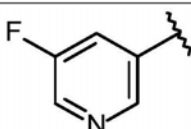
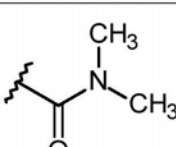
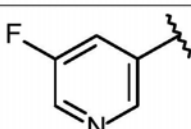
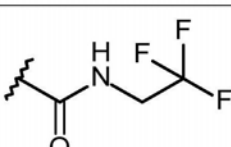
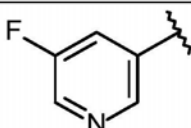
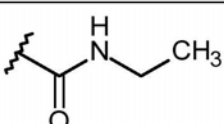
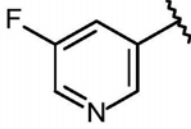
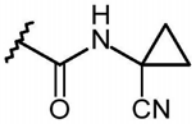
[1247]

化合物 编号	A	R ¹	R ²	收率 [以 mg 计]	纯度 [以 % 计]
1		H		105.6	94.4
2		H		89.4	94.7

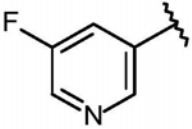
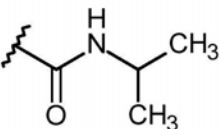
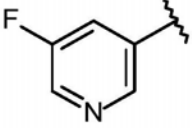
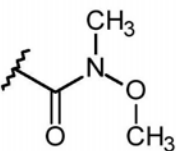
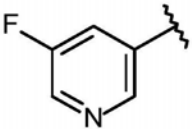
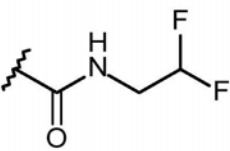
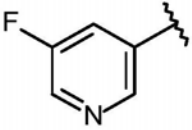
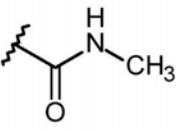
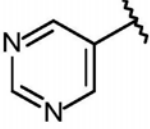
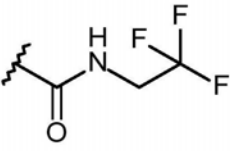
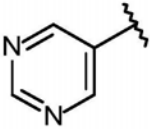
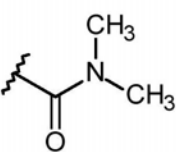
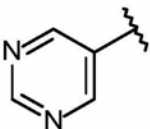
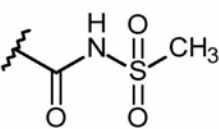
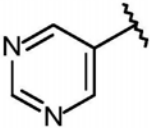
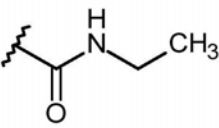
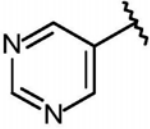
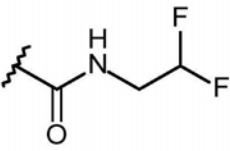
[1248]

化合物 编号	A	R ¹	R ²	收率 [以 mg 计]	纯度 [以 % 计]
3		H		144.4	97.7
4 *)		H		11.5	98.9
5 *)		H		17.2	86.4
6 *)		H		30.0	99.1
7 *)		H		51.3	98.4
8 *)		H		32.6	99.4
9 *)		H		43.6	97.2
10 *)		H		33.7	99.3
11 *)		H		54.4	99.9
12 *)		H		56.7	99.2

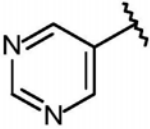
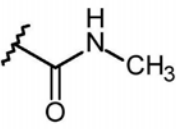
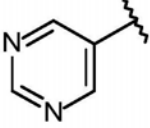
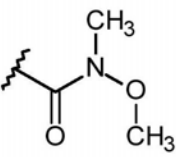
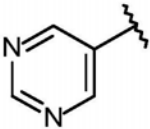
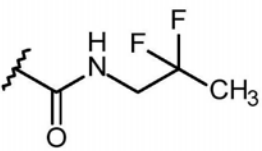
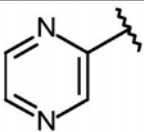
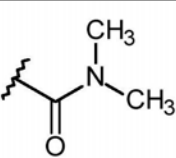
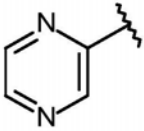
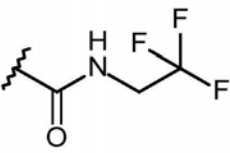
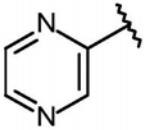
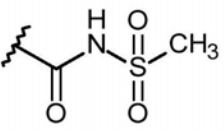
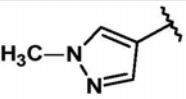
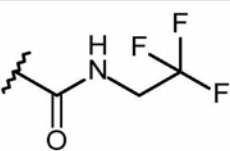
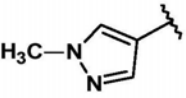
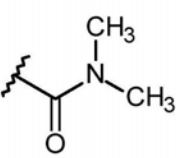
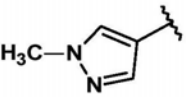
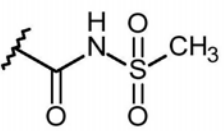
[1249]

化合物 编号	A	R ¹	R ²	收率 [以 mg 计]	纯度 [以 % 计]
13 *)		H		41.2	99.1
14 *)		H		41.5	99.8
15 *)		H		41.6	99.0
16		H		45.9	96.9
17		H		97.5	97.1
18		H		138.4	96.3
19		H		96.3	98.5
20 *)		H		32.1	95.8
21*)		H		23.8	95.9

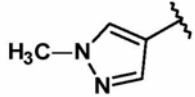
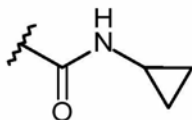
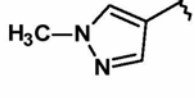
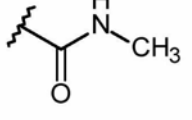
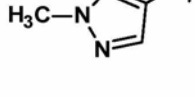
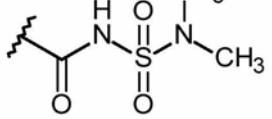
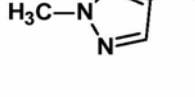
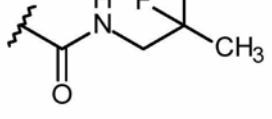
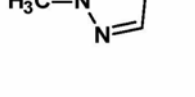
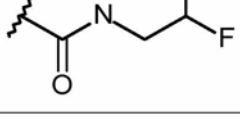
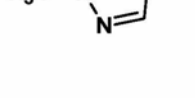
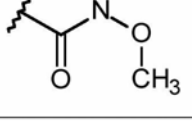
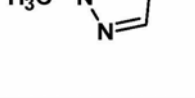
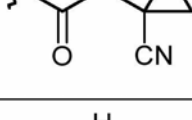
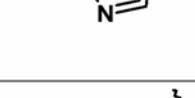
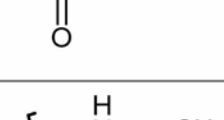

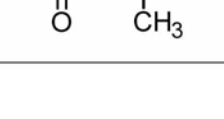
[1250]

化合物 编号	A	R ¹	R ²	收率 [以 mg 计]	纯度 [以 % 计]
22 *)		H		55.2	98.7
23 *)		H		40.2	98.2
24 *)		H		33.1	96.6
25 *)		H		67.3	100
26		H		64.3	91.8
27		H		45.6	96.5
28		H		67.2	96.8
29		H		35.6	85.8
30		H		10.9	87.1

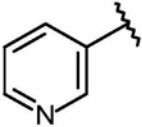
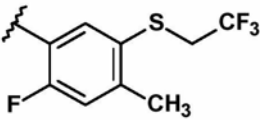
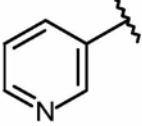
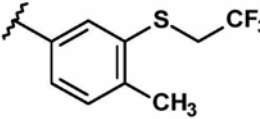
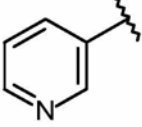
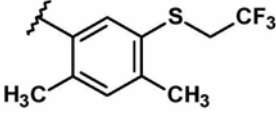
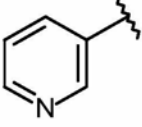
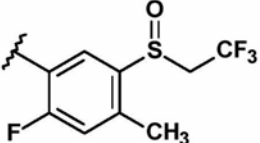
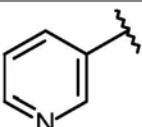
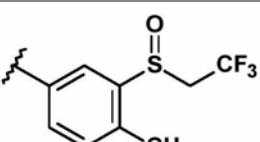
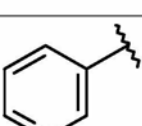
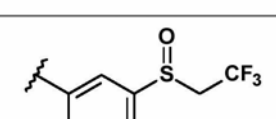
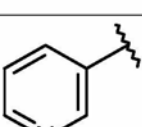
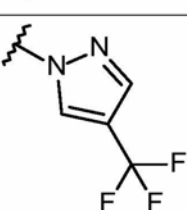
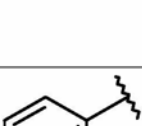
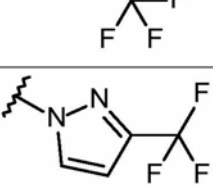
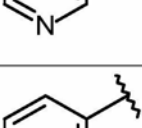
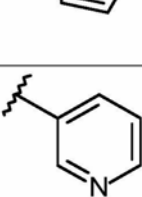
[1251]

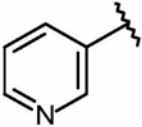
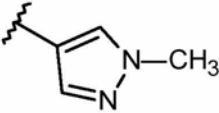
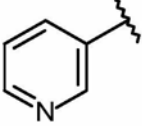
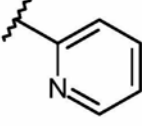
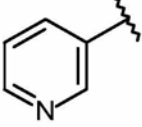
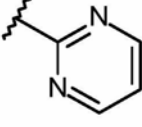
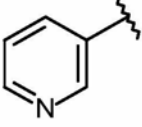
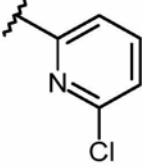
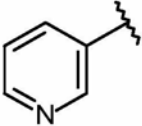
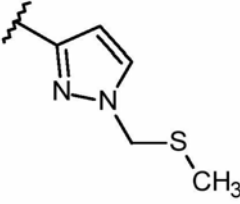
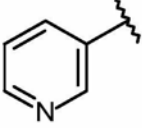
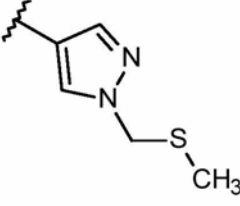
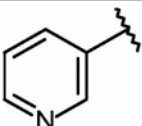
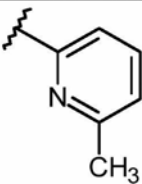
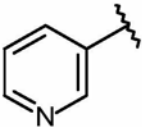
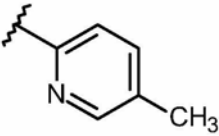
化合物 编号	A	R ¹	R ²	收率 [以 mg 计]	纯度 [以 % 计]
31		H		14.3	85.8
32		H		11.7	86.5
33		H		12.6	94.0
34		H		76.2	94.4
35		H		106.5	98.4
36		H		259.8	91.9
37		H		78.7	96.7
38		H		80.5	99.7
39		H		51.8	92.8

[1252]

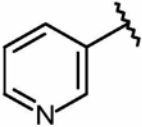
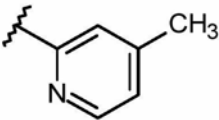
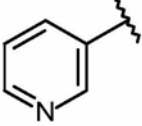
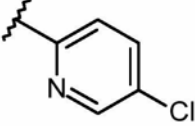
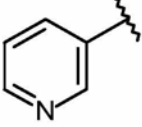
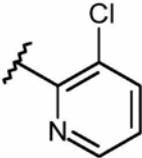
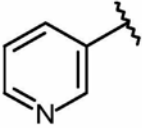
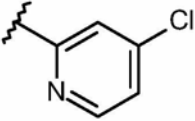
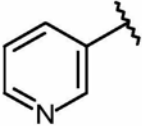
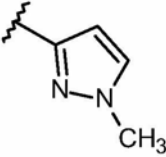
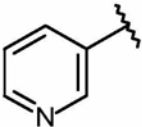
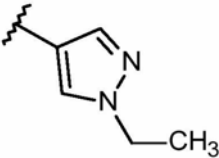
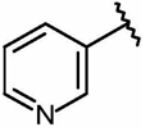
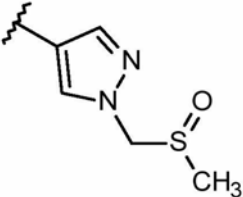
化合物 编号	A	R ¹	R ²	收率 [以 mg 计]	纯度 [以 % 计]
40		H		53.7	99.2
41		H		60.4	99.6
42		H		37.7	100
43		H		67.4	99.4
44		H		78.3	98.5
45		H		64.7	98.6
46		H		78.5	98.7
47		H		62.7	99.4
48		H		65.3	98.4

[1253]

化合物 编号	A	R ¹	R ²	收率 [以 mg 计]	纯度 [以 % 计]
49		H		392	93
50		H		149	97
51		H		37	98
52		H		60	100
53		H		64	100
54		H		54	100
55		H		17	94
56		H		167	100
57		H		80	100

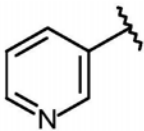
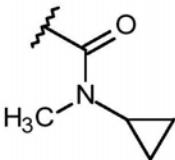
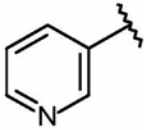
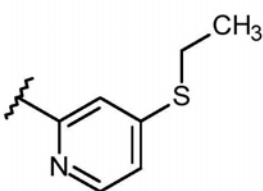
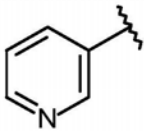
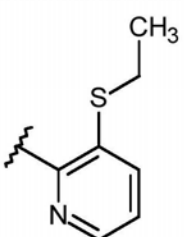
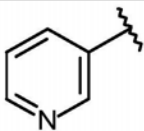
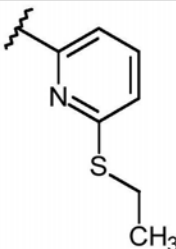
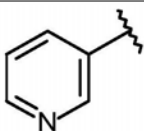
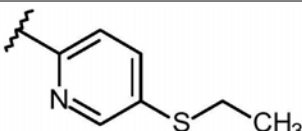
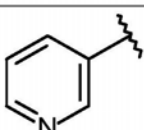
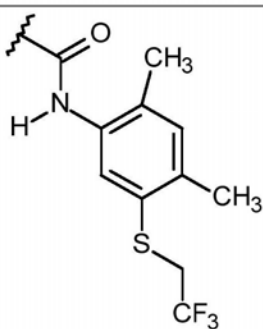
化合物 编号	A	R ¹	R ²	收率 [以 mg 计]	纯度 [以 % 计]
58		H		26	100
59		H		25	100
60		H		60	96
61		H		56	100
62		H		10	97
63		H		62	100
64		H		34	96
65		H		40	98

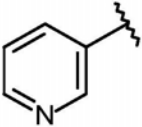
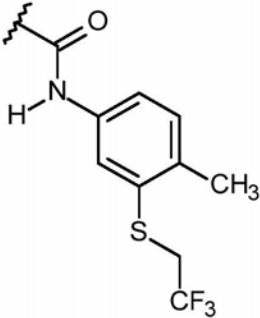
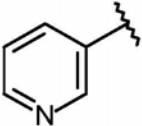
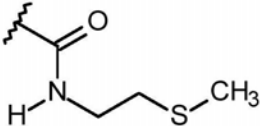
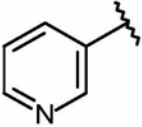
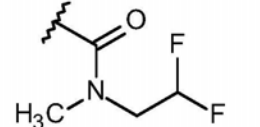
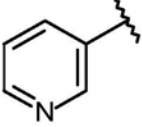
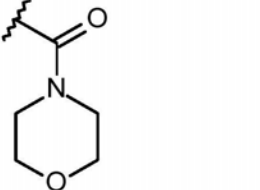
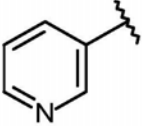
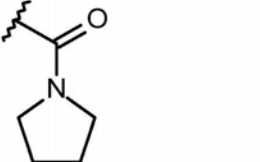
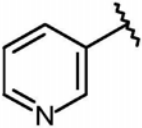
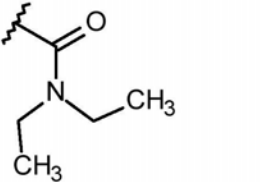
[1254]

化合物 编号	A	R ¹	R ²	收率 [以 mg 计]	纯度 [以 % 计]
66		H		49	100
67		H		73	97
68		H		55	97
69		H		46	100
71		H		39	98
73		H		21	100
74		H		55	91

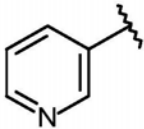
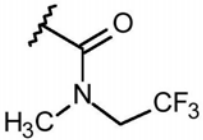
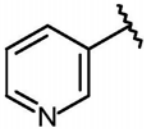
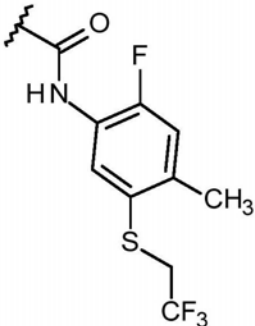
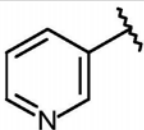
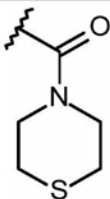
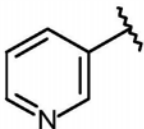
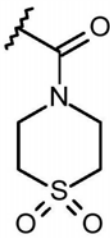
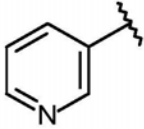
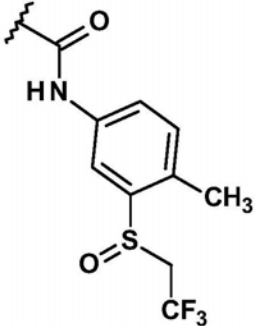
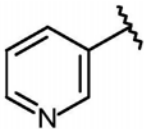
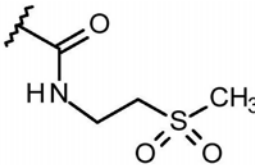
[1255]

[1256]

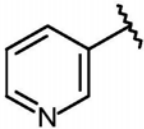
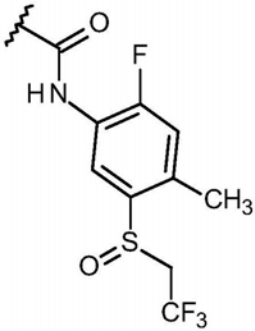
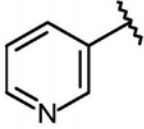
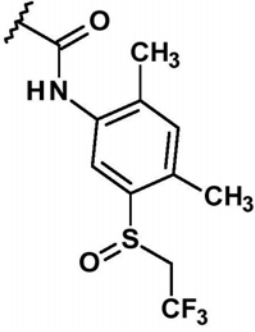
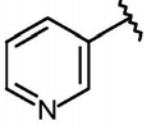
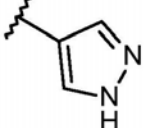
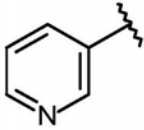
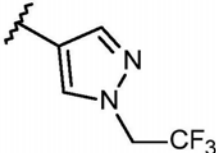
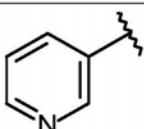
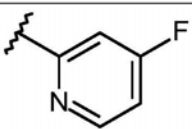
化合物 编号	A	R ¹	R ²	收率 [以 mg 计]	纯度 [以 % 计]
75		H		43	100
76		H		38	100
77		H		37	100
79		H		100	96
80		H		32	97
81		H		28	90

化合物 编号	A	R ¹	R ²	收率 [以 mg 计]	纯度 [以 % 计]
82		H		32	99
85		H		48	100
86		H		55	100
87		H		81	100
88		H		11	100
89		H		12	100

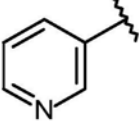
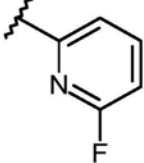
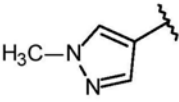
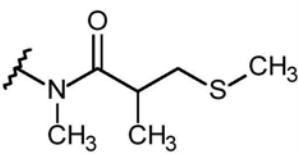
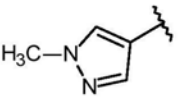
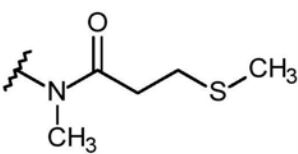
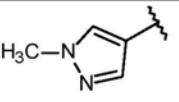
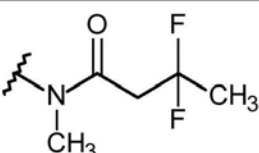
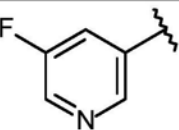
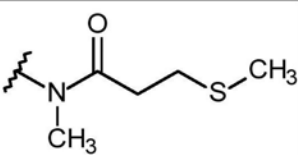
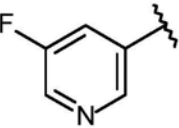
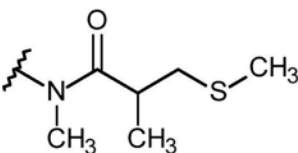
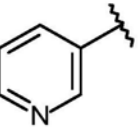
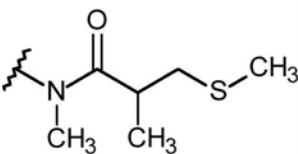
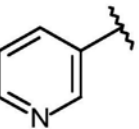
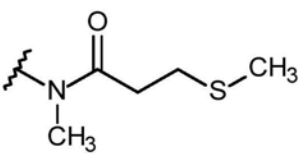
[1257]

化合物 编号	A	R ¹	R ²	收率 [以 mg 计]	纯度 [以 % 计]
90		H		65	100
91		H		93	99
92		H		79	100
93		H		49	100
94		H		37	95
95		H		59	100

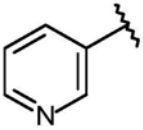
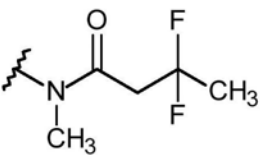
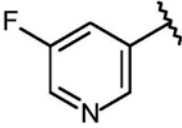
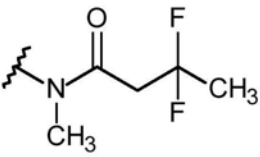
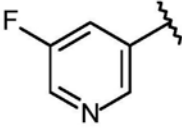
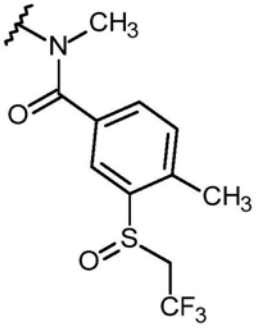
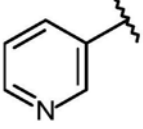
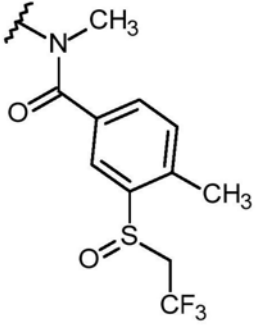
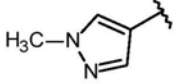
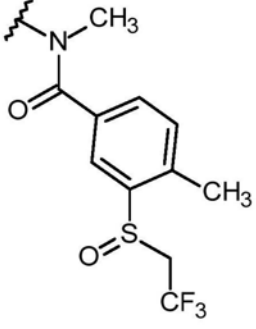
[1258]

化合物 编号	A	R ¹	R ²	收率 [以 mg 计]	纯度 [以 % 计]
96		H		51	95
97		H		15	97
98		H		35	100
99		H		35	100
101		H			

[1259]

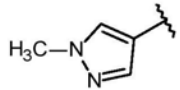
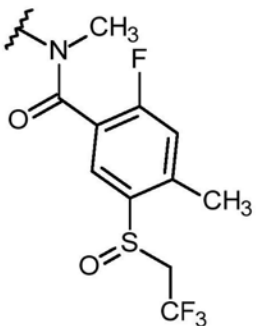
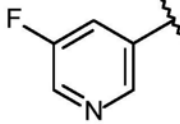
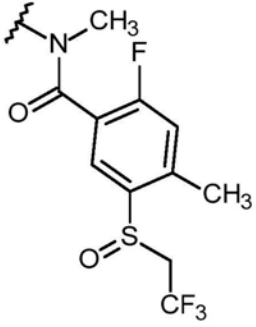
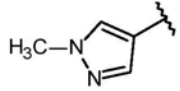
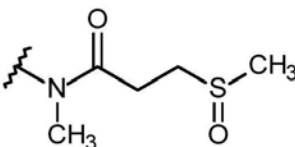
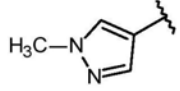
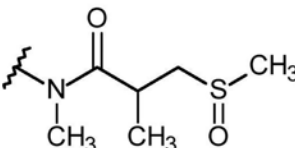
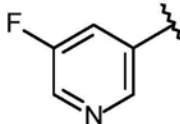
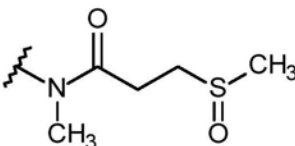
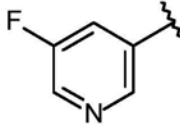
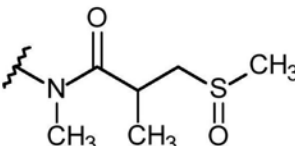
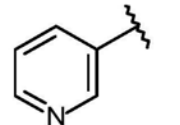
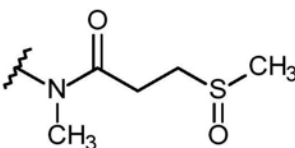
化合物 编号	A	R ¹	R ²	收率 [以 mg 计]	纯度 [以 % 计]
104		H			
105		H		40.8	98
106		H		54.5	97
107		H		59.7	98
108		H		58.4	98
109		H		41.3	100
110		H		50.9	97
111		H		42.1	98

[1260]

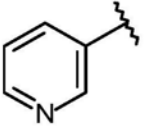
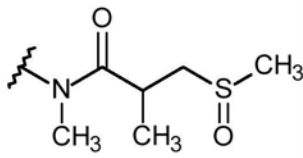
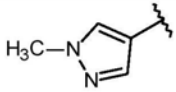
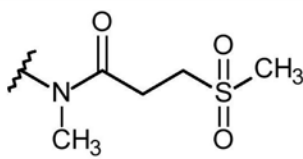
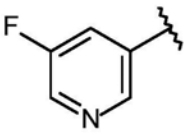
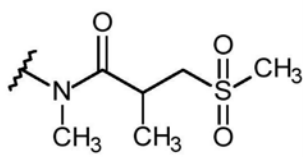
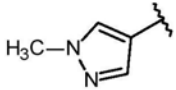
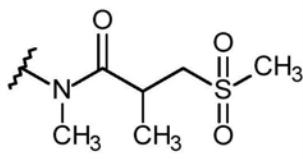
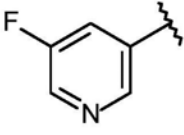
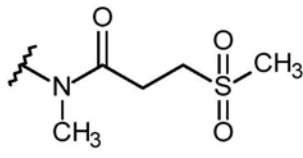
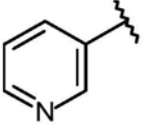
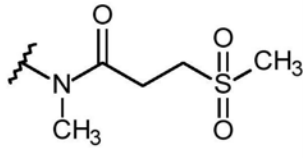
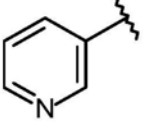
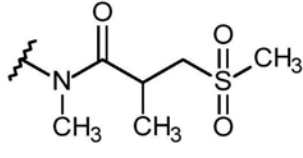
化合物 编号	A	R ¹	R ²	收率 [以 mg 计]	纯度 [以 % 计]
112		H		44.4	99
113		H		34.2	89
114		H		42.4	89
115		H		44	99
116		H		42.4	89

[1261]

[1262]

化合物 编号	A	R ¹	R ²	收率 [以 mg 计]	纯度 [以 % 计]
117		H		45.5	96
118		H		42.9	94
119		H		43.7	86
120		H		60.1	95
121		H		45.6	85
122		H		42.6	99
123		H		42.9	98

[1263]

化合物 编号	A	R ¹	R ²	收率 [以 mg 计]	纯度 [以 % 计]
124 ^{*)}		H		55.7	100
125		H		59.9	97
126 ^{**)}		H		73.3	97
127 ^{**)}		H		54	98
128		H		44.2	95
129		H		41.3	100
130		H		42.7	100

[1264] *) 用1×HCOOH结晶;**) 用1×CH₃COOH结晶

[1265] 表2

[1266] 所报道的化合物1-48和105-128的分析数据

[1267]

实施例编号	停留时间[min]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
1	1.725	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 3.01 (s, 6H, 2 x CH ₃); 7.36; 7.67; 7.79; 7.88; 8.50; 8.67; 9.29;

[1268]

实施例编号	停留时间[min]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
		9.34 (8H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 267.1 (M+1); 266.29 (计算值)
2	1.203	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 3.23 (s, 3H, CH ₃); 7.66; 7.76; 7.86; 7.52; 8.68; 9.36; 9.44 (8H, =CH, 芳基/杂芳基); 12.4 (br. 1H, NH). LC-MS = 317.1 (M+1); 316.33 (计算值)
3	1.203	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 4.13 (m, 2H, CH ₂); 7.67; 7.83; 8.51; 8.54; 8.69; 9.17; 9.36; 9.45 (8H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 320.9 (M ⁺); 320.26 (计算值)
4	2.391	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 1.15; 3.4 (t+ m, 5H, CH ₂ CH ₃); 7.66; 7.78; 8.36; 8.53; 8.67; 9.35; 9.39 (8H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 267.3 (M+1) [无 HCOOH]
5	2.875	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 3.34 (s, 3H, CH ₃); 7.67; 7.81; 8.53; 8.58; 8.68; 9.36; 9.48 (8H, =CH, 芳基/杂芳基); 11.9 (br. 1H, NH). LC-MS = 346.1 (M+1) [无 HCOOH]
6	2.881	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.53; 7.90; 8.11; 8.31; 8.61; 8.73; 9.21 (8H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 364.0 (M+1); 263.21 (计算值)
7	2.319	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 1.64; 3.76 (t+ m, 5H, CH ₂ CF ₂ CH ₃); 7.66; 7.81; 8.45; 8.52; 8.68; 8.92; 9.36; 9.42 (8H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 317.1 (M+1) [无 HCOOH]
8	2.536	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 1.19; 4.12 (d+ m, 7H, CH(CH ₃)); 7.67; 7.79; 8.31; 8.37; 8.51; 8.68; 8.67; 9.37 (8H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 281.3 (M+1) [无 HCOOH]
9	2.448	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 3.34; 3.57 (2s 6H, 2xCH ₃); 7.53; 7.66; 7.76; 8.13; 8.50; 8.67; 9.33 (8H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 283.2 (M+1) [无 HCOOH]
10	2.422	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 0.60; 0.69, 2.86 (3m 5H, 环丙基); 7.65; 7.76; 8.33; 8.51; 8.66; 9.35; 9.38 (8H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 279.3 (M+1) [无 HCOOH]
11	2.261	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 2.81 (s 3H, CH ₃); 7.66; 7.78; 8.35; 8.51; 8.67; 9.35; 9.40 (8H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 253.2 (M+1) [无 HCOOH]
12	2.017	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 2.81 (s 3H,

[1269]

实施例编号	停留时间[min]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
		CH ₃); 7.67; 7.79; 8.40; 8.52; 8.68; 9.36; 9.40; 9.44 (8H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 304.2 (M+1) [无 HCOOH]
13	2.497	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 3.72; 6.16 (2m 3H, CH ₂ CHF ₂); 7.67; 7.82; 8.44; 8.53; 8.68; 8.95; 9.36; 9.43 (8H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 303.2 (M+1) [无 HCOOH]
14	2.342	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 1.64; 3.76 (t+m 5H, CH ₂ CF ₂ CH ₃); 7.79; 7.83; 8.44; 8.54; 8.71; 8.91; 9.29; 9.46 (8H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 335.1 (M+1) [无 HCOOH]
15	3.106	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 0.60; 0.70; 2.86 (3m 5H, 环丙基); 7.74; 7.78; 8.33; 8.55; 8.71; 9.28; 9.42 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 297.0 (M+1) [无 HCOOH]
16	2.902	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.53; 7.88; 8.10; 8.14; 8.58; 8.63; 9.04 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 282.0 (M+1); 281.20 (计算值)
17	3.142	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 3.1 (s, 3H, CH ₃); 7.72; 7.91; 8.49; 8.55; 8.71; 9.29; 9.45 (7H, =CH, 芳基/杂芳基), 12.3 (br, 1H, NH). LC-MS = 335.0 (M+1); 334.32 (计算值)
18	1.983	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 3.01 (s, 6H, 2 x CH ₃); 7.37; 7.79; 7.89; 8.54; 8.72; 9.28; 9.35 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 385.1 (M+1); 284.28 (计算值)
19	2.745	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 4.13 (m, 2H, CH ₂); 7.83; 8.47; 8.56; 8.72; 9.18; 9.30; 9.48 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 339.1 (M+1); 338.25 (计算值)
20	2.962	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 1.15; 3.31 (t+q, 5H, CH ₂ CH ₃); 7.76; 7.80; 8.36; 8.53; 8.71; 9.29; 9.43 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 285.0 (M+1) [无 HCOOH]
21	2.248	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 1.32; 1.58 (2m, 4H, CH ₂ CH ₂); 8.54; 8.55; 8.57; 8.73; 9.29; 9.41; 9.48 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 322.2 (M+1) [无 HCOOH]
22	2.820	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 1.19; 4.12 (d+m, 7H, CH(CH ₃)); 7.76; 7.81; 8.37; 8.56; 8.71; 9.29; 9.42 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 299.2 (M+1) [无 HCOOH]

[1270]

实施例编号	停留时间[min]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
23	2.732	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 3.30; 3.57 (d+m, 7H, CH(CH ₃)); 7.53; 7.76; 8.13; 8.54; 8.72; 9.27; 9.39 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 301.2 (M+1) [无 HCOOH]
24	2.781	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 3.70; 6.16 (2m 3H, CH ₂ CHF ₂); 7.82; 8.44; 8.56; 8.72; 8.96; 9.29; 9.47 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 321.2 (M+1) [无 HCOOH]
25	2.344	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 2.81 (s, 3H, CH ₃); 7.78; 7.82; 8.35; 8.55; 8.71; 9.28; 9.44 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 271.0 (M+1) [无 HCOOH]
26	2.132	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 4.14 (m, 2H, CH ₂); 7.83; 8.49; 9.18; 9.30; 9.37; 9.51; 9.58 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 322.0 (M+1); 321.25 (计算值)
27	1.768	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 2.99 (s, 6H, 2 x CH ₃); 7.35; 7.37; 7.78; 7.89; 9.27; 9.34; 9.54 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 268.1 (M+1); 267.28 (计算值)
28	2.349	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 2.87 (s, 3H, CH ₃); 7.63; 7.98; 8.40; 9.26; 9.37; 9.55 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 318.2 (M+1); 317.32 (计算值)
29	1.872	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 2.87 (s, 3H, CH ₃); 7.80; 8.38; 8.56; 9.29; 9.46; 9.57 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 268.2 (M+1); 267.28 (计算值)
30	1.969	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 2.87 (s, 3H, CH ₃); 7.83; 8.45; 8.95; 9.29; 9.49; 9.57 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 304.2 (M+1); 303.26 (计算值)
31	1.967	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 2.81 (s, 3H, CH ₃); 7.80; 8.37; 8.52; 9.28; 9.46; 9.56 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 254.1 (M+1); 253.25 (计算值)
32	1.895	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 3.30; 3.57 (2s, 6H, 2xCH ₃); 7.55; 8.79; 8.15; 9.29; 9.40; 9.55 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 284.2 (M+1); 283.28 (计算值)
33	2.031	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 1.64; 3.77 (t+m, 5H, CH ₂ CF ₂ CH ₃); 7.82; 8.46; 8.92; 9.29; 9.48; 9.57 (7H, =CH, 芳基/杂芳基).

[1271]

实施例编号	停留时间[min]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
		LC-MS = 318.1 (M+1); 317.29 (计算值)
34	2.034	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 3.00 (s, 6H, 2 x CH ₃); 7.38; 7.80; 7.91; 8.71; 8.79; 9.34; 9.50 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 268.0 (M+1); 267.28 (计算值)
35	2.322	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 4.12 (m, 2H, CH ₂); 7.83; 7.48; 7.72; 8.80; 9.20; 9.50 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 322.1 (M+1); 321.25 (计算值)
36	2.042	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 2.86 (s, 3H, CH ₃); 7.63; 7.97; 8.46; 8.68; 8.76; 9.35; 9.48 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 318.0 (M+1); 317.32 (计算值)
37	2.447	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 3.92 (s, 3H, CH ₃); 4.11 (m, 2H, CH ₂); 7.71; 7.77; 8.10; 8.44; 9.02; 9.09 (6H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 324.0 (M+1); 323.27 (计算值)
38	1.690	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 2.99 (s, 6H, 2 x CH ₃); 3.92 (s, 3H, CH ₃); 7.29; 7.68; 7.82; 8.08; 8.43; 8.87 (6H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 270.1 (M+1); 269.30 (计算值)
39	1.037	¹ H-NMR(300.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 3.39; 3.93 (2s, 6H, 2 x CH ₃); 7.74; 8.12; 8.48; 8.53; 9.09 (6H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 320.0 (M+1); 319.33 (计算值)
40	1.997	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 0.59; 0.69; 2.85 (3m, 5H, 环丙基); 3.92 (s, 3H, CH ₃); 7.66; 7.73; 8.09; 8.27; 8.45; 8.96 (6H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 282.1 (M+1); 281.31 (计算值)
41	1.843	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 2.80; 3.92; (2s, 6H, 2xCH ₃); 7.67; 7.73; 8.09; 8.29; 8.45; 8.98 (6H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 282.1 (M+1); 255.27 (计算值)
42	1.695	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 2.89; 3.92; (2s, 6H, 2xCH ₃); 7.71; 7.75; 7.76; 8.12; 8.48; 9.06 (6H, =CH, 芳基/杂芳基), 11.79 (br, 1H, NH). LC-MS = 349.1 (M+1); 348.38 (计算值)
43	2.350	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 1.63; 3.76 (t+m, 5H, CH ₂ CF ₂ CH ₃); 3.92 (s, 1H, CH ₃); 7.74; 8.10; 8.38; 8.46; 8.84; 9.00 (6H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 320.1 (M+1); 319.3093

[1272]

实施例编号	停留时间[min]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
44	2.454	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 3.68; 6.14 (2m, 3H, CH ₂ CHF ₂); 3.92 (s, 1H, CH ₃); 7.75; 8.10; 8.37; 8.45; 8.88; 9.01 (6H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 306.1 (M+1); 305.28 (计算值)
45	2.033	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 3.28; 3.33; 3.92 (2s, 9H, 3xCH ₃); 3.92 (s, 1H, CH ₃); 7.49; 7.68; 8.09; 8.44; 8.93 (6H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 286.1 (M+1); 285.30 (计算值)
46	2.053	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 1.29; 1.56; (2m, 4H, 2xCH ₂); 3.92 (s, 1H, CH ₃); 7.71; 8.10; 8.34; 8.46; 9.02; 9.34 (6H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 307.1 (M+1); 306.32 (计算值)
47	1.968	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 1.14; 3.29; (t+q, 5H, CH ₂ CH ₃); 3.92 (s, 1H, CH ₃); 7.67; 7.75; 8.09; 8.30; 8.49; 8.97 (6H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 270.1 (M+1); 269.30 (计算值)
48	2.127	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 1.18; 4.13 (d+m, 5H, CH(CH ₃) ₂); 3.92 (s, 3H, CH ₃); 7.70; 8.09; 8.24; 8.31; 8.45; 8.95 (6H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 284.2 (M+3); 283.32 (计算值)
105		¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ= 0.99 (3H, d, J=6.4 Hz), 1.79 (3H, s), 2.30 (1H, dd, JI=11.8 Hz, J2=4.9 Hz), 2.57-2.77 (2H, m), 3.21 (3H, s), 3.93 (3H, s), 7.22 (1H, dd, JI=9.0 Hz, J2=1.7 Hz), 7.71-7.81 (2H, m), 8.08 (1H, s), 8.43 (1H, s), 8.86 (1H, s).
106	1.10	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ = 1.88 (3H, s), 2.34 (2H, t, J=7.1 Hz), 2.62 (2H, t, J=7.1 Hz), 3.20 (3H, s), 3.93 (3H, s), 7.21 (1H, dd, JI=8.9 Hz, J2=1.5 Hz), 7.70-7.79 (2H, m), 8.08 (1H, s), 8.44 (1H, s), 8.85 (1H, s). LC-MS = 330.2 (M+1); 329.42 (计算值)
108	1.20	¹ H-NMR(300.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 1.22; 1.89; 2.34; 2.62; 3.21 (烷基); 7.30; 7.83; 5.52; 8.70; 9.26; 9.30 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 345.2 (M+1); 344.41 (计算值)
109	1.26	¹ H-NMR(300.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 0.99; 1.02; 1.81; 2.69-2.73; 3.21 (烷基); 7.29; 7.32; 7.82; 7.84; 7.87; 8.51; 8.54; 8.71; 8.72; 9.27; 9.32 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 359.2 (M+1); 358.44 (计算值)
119	1.16	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ = 2.55 (3H, s),

[1273]

实施例编号	停留时间[min]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
		2.59-2.72 (2H, m), 2.79-2.90 (1H, m), 3.05-3.18 (1H, m), 3.33 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.10 (1H, dd, <i>J</i> 1=9.0 Hz, <i>J</i> 2=1.9 Hz), 7.54 (1H, d, <i>J</i> =1.3 Hz), 7.80 (1H, d, <i>J</i> =9.0 Hz), 7.89 (1H, s), 7.94 (1H, s), 8.22 (1H, s). LC-MS = 346.2 (M+1); 345.42 (计算值)
120	0.86	¹ H-NMR(300.0 MHz, d ₆ -CDCl ₃): δ= 1.13; 1.21; 2.50; 3.14; 3.25; 3.33; 3.99 (烷基); 7.12-7.18; 7.55-7.8; 8.23 (6H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 360.2 (M+1); 359.45 (计算值)
121	0.94	¹ H-NMR(300.0 MHz, d ₆ -CDCl ₃): δ= 1.25; 1.62; (烷基); 7.14; 7.60; 7.84; 8.09; 8.12; 8.51; 8.56; 9.02 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 361.2 (M+1); 360.41 (计算值)
125	0.90	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ = 2.70 (2H, t, <i>J</i> =7.2 Hz), 2.94 (3H, s), 3.35 (3H, s), 3.40 (2H, t, <i>J</i> =7.2 Hz), 4.03 (3H, s), 7.12 (1H, dd, <i>J</i> 1=9.0 Hz, <i>J</i> 2=1.6 Hz), 7.57 (1H, s), 7.83 (1H, d, <i>J</i> =8.8 Hz), 7.92 (1H, s), 7.97 (1H, s), 8.25 (1H, s) LC-MS = 362.2 (M+1); 361.42 (计算值)
126	1.05	¹ H-NMR(300.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 1.05; 1.07; 1.76; 2.86; 3.21 (烷基); 7.32; 7.35; 7.85; 7.88; 8.51; 8.55; 8.71; 9.27; 9.34 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 490.1 (M+1); [无 CH ₃ COOH]
127	0.92	¹ H-NMR(300.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 1.04; 1.78; 2.96; 3.92 (烷基); 7.24; 7.75; 7.78; 8.08; 8.43; 8.88 (6H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 376.1 (M+1); [无 CH ₃ COOH]
128	2.12	¹ H-NMR(300.0 MHz, d ₆ -CDCl ₃): δ= 2.69; 2.94; 3.38; 3.42 (烷基); 7.15; 7.60; 7.86; 7.89; 8.12; 8.55; 9.01 (7H, =CH, 芳基/杂芳基). LC-MS = 377.1 (M+1); 376.41 (计算值)

[1274] 表3

[1275] 所报道的化合物49-104的分析数据

[1276]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
49	4.23	4.11	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.374 (3.5); 9.367 (3.5); 9.306 (5.9); 9.305 (5.9); 8.686 (2.4); 8.682 (2.6); 8.674 (2.5); 8.671 (2.6); 8.541 (1.3); 8.537 (1.5); 8.534 (1.5); 8.531 (1.3); 8.520 (1.5); 8.516 (1.5); 8.513 (1.7); 8.510 (1.4); 8.228 (0.3); 7.975 (3.7); 7.860 (2.7); 7.837 (3.1); 7.774 (3.1);

[1277]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
			7.754 (3.2); 7.687 (1.9); 7.675 (1.9); 7.666 (1.9); 7.655 (1.9); 7.558 (1.3); 7.553 (2.2); 7.549 (1.3); 7.535 (1.1); 7.531 (2.0); 7.527 (1.1); 7.338 (2.8); 7.309 (2.7); 4.066 (1.3); 4.040 (4.2); 4.014 (4.4); 3.988 (1.5); 3.335 (28.4); 2.893 (0.4); 2.528 (0.5); 2.514 (12.2); 2.510 (24.6); 2.505 (32.5); 2.501 (24.0); 2.496 (11.9); 2.453 (16.0); 2.406 (0.4); 1.397 (1.7).
50	4.12	4.07	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.377 (3.4); 9.371 (3.5); 9.274 (5.9); 9.272 (6.2); 8.678 (2.3); 8.675 (2.6); 8.666 (2.5); 8.663 (2.7); 8.542 (1.4); 8.539 (1.6); 8.536 (1.6); 8.532 (1.4); 8.522 (1.5); 8.518 (1.6); 8.515 (1.7); 8.511 (1.5); 8.072 (4.1); 7.858 (2.7); 7.855 (2.3); 7.851 (3.7); 7.847 (3.9); 7.835 (3.6); 7.731 (2.9); 7.727 (2.9); 7.708 (2.1); 7.704 (2.1); 7.681 (1.9); 7.669 (1.9); 7.660 (1.9); 7.648 (1.9); 7.587 (1.9); 7.583 (1.9); 7.568 (2.3); 7.563 (2.3); 7.380 (3.2); 7.360 (2.6); 4.171 (1.3); 4.145 (4.3); 4.119 (4.4); 4.093 (1.5); 3.349 (0.4); 3.334 (63.3); 2.673 (0.3); 2.526 (0.8); 2.513 (18.3); 2.509 (37.9); 2.504 (50.6); 2.499 (37.8); 2.495 (19.1); 2.416 (16.0); 2.331 (0.3); 1.397 (0.4).
51	4.42	4.40	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.366 (3.2); 9.359 (3.2); 9.247 (5.6); 9.245 (5.6); 8.679 (2.2); 8.676 (2.4); 8.667 (2.3); 8.664 (2.4); 8.533 (1.3); 8.529 (1.5); 8.526 (1.5); 8.523 (1.3); 8.512 (1.4); 8.508 (1.5); 8.505 (1.6); 8.502 (1.4); 7.810 (2.7); 7.788 (3.0); 7.706 (4.1); 7.681 (1.8); 7.670 (1.7); 7.661 (1.7); 7.649 (1.7); 7.441 (5.8); 7.352 (2.5); 7.348 (2.5); 7.329 (2.3); 7.325 (2.4); 7.236 (4.8); 3.979 (1.3); 3.953 (4.0); 3.927 (4.2); 3.901 (1.4); 3.335 (13.6); 2.528 (0.4); 2.524 (0.6); 2.515 (8.4); 2.510 (17.5); 2.506 (23.5); 2.501 (17.5); 2.497 (8.7); 2.409 (14.6); 2.242 (16.0); 0.000 (1.1).
52	2.80	2.74	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.377 (3.5); 9.371 (3.5); 9.323 (6.1); 9.321 (5.9); 8.692 (2.5); 8.688 (2.7); 8.680 (2.6); 8.677 (2.7); 8.545 (1.4); 8.541 (1.6); 8.538 (1.5); 8.535 (1.4); 8.524 (1.6); 8.521 (1.6); 8.518 (1.7); 8.514 (1.4); 8.059 (7.0); 8.039 (3.4); 7.900 (2.8); 7.878 (3.3); 7.693 (1.9); 7.692 (1.9); 7.681 (1.8); 7.673 (1.8); 7.661 (1.8); 7.660 (1.8); 7.613 (1.3); 7.609 (2.3); 7.605 (1.3); 7.591 (1.2); 7.587 (2.0); 7.582 (1.1); 7.447 (2.6); 7.418 (2.5); 4.298 (0.5); 4.288 (0.5); 4.271 (0.7); 4.261 (1.7); 4.243 (0.4); 4.233 (2.1); 4.203 (1.8); 4.193 (0.6); 4.175 (0.6); 4.166 (0.6); 3.329 (42.3); 2.677 (0.4); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.525 (1.4); 2.512 (28.8); 2.508 (57.1); 2.503 (74.6); 2.499 (54.0); 2.494 (25.9); 2.451 (16.0); 2.334 (0.4); 2.330 (0.5); 2.325 (0.4); 1.990 (0.7); 1.176 (0.4); 0.008 (1.4); 0.000 (41.3); -0.009 (1.3).
53	2.72	2.68	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.379 (3.6); 9.373 (3.7); 9.294 (6.2); 9.293 (6.0); 8.686 (2.5); 8.683 (2.7); 8.674 (2.7); 8.671 (2.7); 8.546 (1.4); 8.542 (1.7); 8.539 (1.6); 8.536 (1.4); 8.525 (1.6);

[1278]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
			8.521 (1.7); 8.518 (1.8); 8.515 (1.5); 8.196 (4.0); 8.191 (4.2); 8.144 (4.2); 7.910 (2.1); 7.900 (2.9); 7.890 (2.4); 7.885 (2.4); 7.877 (3.7); 7.778 (2.9); 7.774 (2.8); 7.755 (2.0); 7.751 (2.0); 7.689 (1.9); 7.677 (1.9); 7.669 (1.9); 7.657 (1.8); 7.485 (3.0); 7.465 (2.7); 4.257 (0.4); 4.247 (0.6); 4.230 (0.8); 4.220 (1.9); 4.206 (1.8); 4.193 (2.0); 4.178 (2.0); 4.166 (0.8); 4.151 (0.7); 4.142 (0.4); 3.331 (136.6); 2.676 (0.5); 2.672 (0.7); 2.667 (0.5); 2.525 (1.9); 2.512 (38.7); 2.507 (77.7); 2.503 (102.1); 2.498 (75.9); 2.494 (38.6); 2.437 (16.0); 2.334 (0.5); 2.330 (0.7); 2.325 (0.5); 1.989 (0.6); 0.008 (0.5); 0.000 (14.6); -0.008 (0.7).
54	2.99	2.92	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.371 (3.3); 9.365 (3.5); 9.263 (5.7); 8.681 (2.5); 8.672 (2.5); 8.669 (2.6); 8.536 (1.6); 8.534 (1.6); 8.515 (1.7); 8.513 (1.7); 8.510 (1.4); 7.847 (2.6); 7.825 (2.9); 7.788 (4.4); 7.753 (6.3); 7.687 (1.8); 7.675 (1.8); 7.666 (1.8); 7.654 (1.7); 7.404 (2.3); 7.400 (2.4); 7.381 (2.2); 7.378 (2.2); 7.331 (4.8); 4.173 (1.1); 4.146 (3.4); 4.118 (3.5); 4.091 (1.2); 3.329 (83.0); 2.672 (0.9); 2.562 (0.3); 2.507 (107.3); 2.503 (138.4); 2.498 (111.3); 2.403 (14.9); 2.341 (16.0); 1.989 (0.6); 0.146 (0.9); 0.000 (175.9); -0.150 (0.9); 0.000 (16.1); -0.008 (0.6)
55	2.77	2.74	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.379 (2.7); 9.361 (13.4); 9.259 (7.9); 9.210 (0.4); 8.695 (2.3); 8.686 (2.4); 8.550 (2.2); 8.547 (2.6); 8.544 (2.5); 8.541 (2.1); 8.529 (2.4); 8.526 (2.6); 8.523 (2.7); 8.520 (2.2); 8.285 (8.4); 8.237 (9.1); 7.947 (16.0); 7.943 (15.7); 7.693 (2.6); 7.681 (2.6); 7.672 (2.6); 7.660 (2.5); 5.759 (0.7); 3.333 (56.9); 2.678 (0.5); 2.673 (0.7); 2.527 (2.0); 2.513 (40.5); 2.509 (79.4); 2.505 (102.3); 2.500 (75.1); 2.336 (0.5); 2.331 (0.6); 1.245 (0.5); 1.230 (0.5); 0.146 (0.9); 0.022 (0.5); 0.008 (8.3); 0.000 (189.5); -0.009 (7.9); -0.150 (1.0).
56	2.83	2.79	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.375 (8.8); 9.368 (8.8); 9.346 (16.0); 8.809 (7.3); 8.806 (7.4); 8.699 (5.9); 8.696 (6.4); 8.688 (6.1); 8.684 (6.3); 8.547 (3.4); 8.543 (3.9); 8.540 (3.8); 8.537 (3.4); 8.526 (3.7); 8.522 (3.9); 8.519 (4.1); 8.516 (3.4); 8.318 (0.5); 8.277 (9.1); 8.274 (8.8); 7.968 (3.2); 7.944 (11.9); 7.930 (9.9); 7.925 (9.3); 7.907 (2.6); 7.902 (2.8); 7.695 (4.7); 7.683 (4.6); 7.674 (4.6); 7.662 (4.4); 7.076 (8.5); 7.070 (8.5); 3.332 (215.6); 2.677 (0.9); 2.673 (1.2); 2.669 (0.9); 2.526 (3.4); 2.513 (66.6); 2.508 (131.4); 2.504 (171.9); 2.499 (127.4); 2.335 (0.8); 2.331 (1.2); 2.326 (0.8); 1.990 (0.6); 0.000 (0.7).
57	0.88	1.71	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.384 (9.1); 9.377 (9.3); 9.309 (16.0); 8.988 (8.7); 8.983 (8.9); 8.685 (5.7); 8.682 (6.6); 8.673 (6.1); 8.670 (6.6); 8.591 (5.6); 8.587 (6.3); 8.579 (6.0); 8.575 (6.2); 8.554 (3.3); 8.550 (3.9); 8.547 (4.0); 8.544 (3.5);

[1279]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
			8.533 (3.6); 8.529 (4.0); 8.527 (4.3); 8.523 (3.6); 8.318 (0.3); 8.179 (3.3); 8.173 (4.8); 8.169 (3.6); 8.154 (15.7); 7.898 (6.3); 7.876 (8.7); 7.754 (7.1); 7.750 (7.3); 7.732 (5.3); 7.727 (5.5); 7.686 (5.1); 7.674 (5.0); 7.665 (5.0); 7.653 (4.8); 7.528 (4.8); 7.516 (4.7); 7.508 (4.6); 7.496 (4.4); 3.332 (103.5); 2.677 (0.7); 2.673 (0.9); 2.669 (0.7); 2.526 (2.4); 2.508 (102.3); 2.504 (136.8); 2.499 (104.3); 2.335 (0.6); 2.331 (0.9); 2.326 (0.7); 1.990 (0.4); 1.259 (0.4); 1.250 (0.3); 1.230 (0.5); 0.000 (5.7).
58	1.51	1.57	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.349 (2.4); 9.343 (2.4); 9.149 (4.2); 9.147 (4.1); 8.656 (1.7); 8.653 (1.8); 8.645 (1.8); 8.641 (1.8); 8.511 (1.0); 8.507 (1.2); 8.504 (1.1); 8.501 (1.0); 8.490 (1.1); 8.486 (1.2); 8.483 (1.2); 8.480 (1.0); 8.199 (4.4); 7.943 (4.6); 7.942 (4.5); 7.913 (3.2); 7.757 (1.8); 7.735 (2.5); 7.664 (1.3); 7.663 (1.3); 7.652 (1.3); 7.643 (1.3); 7.631 (1.3); 7.630 (1.3); 7.618 (2.1); 7.614 (2.1); 7.596 (1.6); 7.592 (1.6); 3.885 (16.0); 3.334 (44.0); 2.526 (0.9); 2.512 (17.3); 2.508 (34.2); 2.504 (44.4); 2.499 (32.6); 2.495 (16.2); 1.232 (0.8); 0.000 (7.6).
59	1.13	1.93	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.378 (9.5); 9.371 (9.4); 9.330 (15.8); 9.329 (16.0); 8.697 (5.2); 8.695 (5.4); 8.684 (11.3); 8.681 (10.9); 8.672 (6.8); 8.669 (6.8); 8.548 (3.8); 8.544 (4.4); 8.541 (4.4); 8.537 (4.3); 8.527 (14.6); 8.520 (5.2); 8.517 (3.9); 8.318 (0.6); 8.167 (6.3); 8.163 (6.1); 8.144 (7.2); 8.140 (7.2); 8.078 (6.7); 8.058 (8.6); 7.926 (3.6); 7.921 (3.6); 7.906 (5.6); 7.902 (5.5); 7.887 (3.1); 7.883 (3.1); 7.856 (8.5); 7.833 (7.4); 7.686 (5.2); 7.675 (5.0); 7.666 (5.0); 7.654 (4.8); 7.373 (4.1); 7.371 (4.3); 7.359 (4.5); 7.355 (4.3); 7.353 (4.0); 7.342 (3.8); 7.340 (3.8); 3.336 (231.2); 2.677 (1.2); 2.672 (1.6); 2.668 (1.2); 2.526 (4.3); 2.512 (90.3); 2.508 (177.5); 2.503 (229.6); 2.499 (167.1); 2.495 (82.5); 2.335 (1.1); 2.330 (1.5); 2.326 (1.1); 2.237 (0.6); 0.008 (2.4); 0.000 (66.9); -0.008 (2.5).
60	1.72	1.73	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.408 (7.7); 9.406 (7.6); 9.373 (4.0); 9.367 (4.0); 8.934 (14.4); 8.922 (16.0); 8.918 (6.0); 8.915 (4.4); 8.695 (2.8); 8.691 (3.0); 8.683 (2.9); 8.679 (3.0); 8.544 (1.8); 8.541 (2.1); 8.538 (2.0); 8.534 (1.8); 8.524 (2.0); 8.520 (2.1); 8.517 (2.2); 8.513 (1.9); 8.418 (3.6); 8.414 (3.5); 8.395 (3.9); 8.391 (3.9); 7.871 (4.3); 7.848 (4.0); 7.694 (2.3); 7.693 (2.3); 7.682 (2.3); 7.681 (2.3); 7.673 (2.3); 7.672 (2.3); 7.661 (2.2); 7.660 (2.2); 7.456 (3.9); 7.443 (7.3); 7.431 (3.8); 5.761 (0.7); 3.340 (50.8); 2.529 (0.6); 2.524 (0.9); 2.516 (14.0); 2.511 (28.9); 2.507 (38.4); 2.502 (27.9); 2.498 (13.6); 0.000 (5.9).
61	2.79	2.80	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.372(9.4); 9.366 (9.6); 9.351(16.0); 9.350(15.8); 8.692(6.4); 8.688(7.0); 8.680(6.8); 8.677(7.0); 8.555(11.1);

[1280]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
			8.542(4.0); 8.538(4.4); 8.535(4.2); 8.532(3.8); 8.521(4.1); 8.517(4.4); 8.514(4.6); 8.511(3.9); 8.315(0.5); 8.104(8.0); 8.098(6.9); 8.094(6.6); 8.085(10.7); 8.075(7.8); 8.071(7.8); 7.985(7.3); 7.965(12.8); 7.946(6.1); 7.875(9.0); 7.852(7.4); 7.691(5.0); 7.690(5.0); 7.679(4.9); 7.670(4.9); 7.658(4.7); 7.477(10.2); 7.458(9.4); 3.320(58.1); 2.677(0.8); 2.672(1.1); 2.668(0.8); 2.525(2.9); 2.512(61.4); 2.508(125.1); 2.503(166.2); 2.499(123.8); 2.494(62.2); 2.334(0.8); 2.330(1.1); 2.325(0.8); 1.398(4.1); 0.146(0.4); 0.008(3.0); 0.000(90.2); -0.008(3.8); -0.150(0.4)
62	1.97	2.11	¹ H-NMR(601.6 MHz, CDCl ₃): δ= 9.216(1.9); 9.212(1.9); 9.199(0.3); 8.704(1.3); 8.702(1.4); 8.697(1.4); 8.694(1.3); 8.554(3.4); 8.553(3.3); 8.440(0.5); 8.323(0.8); 8.320(0.9); 8.318(0.9); 8.316(0.8); 8.309(0.9); 8.306(1.1); 8.304(1.0); 8.302(0.9); 7.900(3.0); 7.882(1.7); 7.867(1.8); 7.854(0.5); 7.814(0.6); 7.596(2.8); 7.593(2.8); 7.537(1.1); 7.529(1.2); 7.523(1.0); 7.515(1.2); 7.464(1.7); 7.462(1.6); 7.449(1.5); 7.447(1.5); 7.261(23.5); 6.412(2.9); 6.409(2.8); 5.220(8.1); 5.210(0.6); 5.196(1.3); 5.082(0.5); 2.289(16.0); 2.248(0.8); 2.228(0.9); 2.200(2.2); 1.574(8.2); 0.005(0.8); 0.000(21.7); -0.006(0.9)
63	2.02		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.353(2.1); 9.347(2.1); 9.158(3.6); 8.659(1.4); 8.656(1.6); 8.648(1.5); 8.644(1.5); 8.515(0.8); 8.511(0.9); 8.509(0.9); 8.505(0.8); 8.494(0.9); 8.491(0.9); 8.488(1.0); 8.484(0.8); 8.337(3.9); 8.031(4.0); 7.965(2.6); 7.771(1.4); 7.748(2.0); 7.664(1.2); 7.652(1.2); 7.645(2.3); 7.643(2.6); 7.631(1.2); 7.623(1.3); 7.619(1.3); 5.290(8.0); 3.322(10.6); 2.525(0.5); 2.512(9.7); 2.508(19.6); 2.503(26.1); 2.499(19.5); 2.494(10.0); 2.190(16.0); 0.008(0.6); 0.000(15.6); -0.008(0.7)
64	1.06	2.41	¹ H-NMR(600.1 MHz, CDCl ₃): δ= 9.217(2.7); 9.213(2.7); 8.675(1.8); 8.674(1.8); 8.668(1.9); 8.666(1.8); 8.532(4.8); 8.371(3.5); 8.323(1.0); 8.321(1.2); 8.320(1.2); 8.317(1.0); 8.309(1.1); 8.307(1.3); 8.306(1.3); 8.303(1.0); 8.045(1.7); 8.042(1.7); 8.030(2.0); 8.027(2.0); 7.873(2.4); 7.858(2.0); 7.676(1.3); 7.663(2.9); 7.650(1.8); 7.590(2.6); 7.577(1.9); 7.514(1.4); 7.506(1.4); 7.500(1.4); 7.493(1.3); 7.262(6.2); 7.118(2.3); 7.106(2.2); 2.657(16.0); 1.652(2.9); 0.000(5.3)
65	1.23	2.25	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): = 9.371(3.6); 9.364(3.6); 9.299(6.0); 8.678(2.4); 8.675(2.6); 8.666(2.5); 8.663(2.5); 8.539(1.5); 8.535(1.8); 8.528(3.7); 8.521(3.4); 8.515(1.9); 8.512(1.8); 8.508(1.4); 8.476(4.4); 8.141(2.3); 8.138(2.2); 8.118(2.7); 8.115(2.6); 7.969(2.8); 7.949(3.3); 7.833(3.1); 7.810(2.8); 7.728(1.8); 7.723(1.9); 7.707(1.6); 7.702(1.6); 7.680(2.0); 7.669(1.9);

[1281]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
			7.660(1.9); 7.648(1.9); 3.318(61.0); 2.675(0.6); 2.671(0.8); 2.667(0.6); 2.506(97.9); 2.502(126.3); 2.498(93.1); 2.353(16.0); 2.333(0.8); 2.329(0.9); 2.324(0.7); 0.146(0.6); 0.008(5.6); 0.000(126.5); -0.008(5.1); -0.150(0.6)
66	0.97	2.2	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.377(3.1); 9.372(3.2); 9.309(5.4); 9.307(5.3); 8.682(2.2); 8.679(2.4); 8.670(2.4); 8.667(2.4); 8.544(1.8); 8.540(4.4); 8.534(1.7); 8.527(3.3); 8.523(2.1); 8.520(1.8); 8.516(2.1); 8.513(4.1); 8.510(4.1); 8.157(2.3); 8.153(2.2); 8.134(2.6); 8.130(2.6); 7.907(3.7); 7.840(3.0); 7.817(2.6); 7.683(1.7); 7.681(1.7); 7.671(1.6); 7.670(1.6); 7.662(1.7); 7.661(1.6); 7.650(1.6); 7.649(1.6); 7.190(2.0); 7.189(2.0); 7.178(2.0); 7.176(2.0); 3.326(10.1); 2.527(0.4); 2.514(9.5); 2.509(19.3); 2.505(25.5); 2.500(19.0); 2.496(9.5); 2.418(16.0); 0.008(1.1); 0.000(32.7); -0.008(1.5)
67	2.8	2.78	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.374(8.4); 9.369(8.5); 9.338(14.7); 9.336(14.2); 8.724(7.9); 8.723(8.3); 8.718(8.4); 8.717(8.0); 8.686(6.0); 8.682(6.6); 8.674(6.4); 8.670(6.5); 8.544(12.8); 8.542(12.8); 8.534(4.1); 8.524(3.9); 8.520(4.0); 8.517(4.3); 8.514(3.6); 8.314(0.6); 8.136(12.2); 8.132(7.9); 8.113(16.0); 8.109(8.4); 8.036(8.1); 8.029(7.8); 8.014(5.4); 8.008(5.5); 7.862(8.2); 7.839(7.1); 7.686(4.7); 7.684(4.6); 7.674(4.5); 7.672(4.4); 7.665(4.5); 7.663(4.4); 7.653(4.5); 7.651(4.3); 7.627(0.5); 7.615(0.3); 7.598(0.4); 3.321(179.5); 2.676(1.0); 2.672(1.3); 2.667(1.0); 2.663(0.5); 2.525(3.2); 2.520(5.0); 2.512(71.7); 2.507(149.0); 2.503(198.9); 2.498(144.8); 2.494(69.7); 2.338(0.4); 2.334(0.9); 2.329(1.3); 2.325(1.0); 1.989(0.8); 1.176(0.4); 0.146(0.4); 0.008(2.9); 0.000(98.3); -0.009(3.3); -0.150(0.4)
68	2.17	2.21	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.371(8.7); 9.365(8.7); 9.336(15.4); 9.334(16.0); 8.689(6.1); 8.686(6.8); 8.678(6.6); 8.674(7.4); 8.671(8.5); 8.667(8.2); 8.659(7.9); 8.656(8.0); 8.540(3.7); 8.537(4.3); 8.534(4.2); 8.530(3.8); 8.520(4.1); 8.516(4.3); 8.513(4.6); 8.509(3.9); 8.160(7.5); 8.158(10.3); 8.157(10.4); 8.154(8.5); 8.090(7.4); 8.086(7.8); 8.069(8.2); 8.066(8.0); 7.851(7.4); 7.831(5.4); 7.829(9.3); 7.827(5.9); 7.689(4.8); 7.687(5.0); 7.677(4.8); 7.675(4.9); 7.665(10.3); 7.661(8.7); 7.656(5.3); 7.655(5.1); 7.642(6.7); 7.638(6.9); 7.629(0.8); 7.617(0.4); 7.601(0.5); 7.567(0.4); 7.552(0.3); 7.549(0.3); 7.473(8.2); 7.462(7.9); 7.453(7.6); 7.441(7.7); 5.756(7.7); 3.324(44.9); 2.674(0.4); 2.528(1.0); 2.523(1.6); 2.514(19.5); 2.510(40.5); 2.505(55.7); 2.501(42.3); 2.496(20.8); 2.332(0.4); 1.250(0.3); 0.008(0.5); 0.000(15.6); -0.009(0.5)
69	2.62	2.66	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.382(9.0);

[1282]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
			9.376(9.2); 9.341(16.0); 8.687(6.1); 8.684(6.6); 8.676(6.6); 8.673(6.7); 8.663(10.4); 8.650(10.4); 8.619(11.1); 8.553(3.6); 8.549(4.2); 8.546(4.1); 8.543(3.6); 8.532(3.9); 8.528(4.3); 8.526(4.4); 8.522(3.6); 8.313(0.6); 8.231(10.8); 8.227(11.2); 8.181(6.0); 8.177(6.0); 8.158(6.9); 8.154(7.0); 7.857(8.3); 7.834(7.3); 7.686(4.9); 7.674(4.8); 7.665(4.8); 7.653(4.6); 7.501(6.7); 7.496(6.8); 7.488(6.5); 7.483(6.5); 3.316(106.8); 2.676(0.9); 2.671(1.2); 2.667(0.9); 2.525(3.7); 2.507(133.7); 2.502(180.6); 2.498(138.2); 2.334(0.9); 2.329(1.3); 2.325(1.0); 0.008(1.2); 0.000(32.1); -0.008(1.3)
71	1.58		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.347(2.4); 9.340(2.5); 9.190(4.2); 8.662(1.6); 8.659(1.8); 8.650(1.7); 8.647(1.7); 8.511(0.9); 8.508(1.1); 8.505(1.1); 8.502(0.9); 8.491(1.0); 8.487(1.1); 8.484(1.1); 8.481(0.9); 8.128(3.2); 7.885(1.4); 7.882(1.4); 7.862(2.0); 7.859(2.1); 7.763(2.5); 7.750(3.0); 7.744(3.5); 7.666(1.3); 7.654(1.9); 7.646(1.4); 7.634(1.2); 6.770(3.2); 6.765(3.3); 6.440(0.7); 6.435(0.7); 3.904(16.0); 3.839(3.7); 3.309(16.0); 2.670(0.4); 2.523(1.2); 2.506(48.7); 2.501(64.0); 2.497(47.7); 2.328(0.4); 0.008(0.3); 0.000(9.5)
73	1.81	1.82	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.348(4.9); 9.342(4.9); 9.141(8.6); 8.652(3.6); 8.643(3.5); 8.641(3.5); 8.506(2.3); 8.503(2.3); 8.485(2.4); 8.482(2.5); 8.252(8.9); 7.945(9.1); 7.920(6.6); 7.755(3.3); 7.732(4.7); 7.661(2.6); 7.650(2.7); 7.640(2.7); 7.629(6.1); 7.608(2.8); 7.605(2.8); 4.196(2.3); 4.178(7.1); 4.159(7.2); 4.141(2.4); 3.319(26.8); 2.671(0.8); 2.502(113.9); 2.329(0.7); 1.447(7.7); 1.428(16.0); 1.410(7.6); 1.336(0.4); 1.250(0.5); 0.146(0.5); 0.000(95.4); -0.150(0.5)
74	1.17	1.19	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.354(2.8); 9.349(3.1); 9.172(4.7); 8.658(2.2); 8.647(2.3); 8.512(1.5); 8.491(1.6); 8.360(0.4); 8.274(4.9); 8.213(0.4); 8.175(5.0); 8.014(0.3); 7.997(3.8); 7.784(1.9); 7.761(2.7); 7.665(1.7); 7.655(3.8); 7.645(1.8); 7.633(3.2); 5.769(0.5); 5.755(0.7); 5.545(2.1); 5.512(2.8); 5.325(2.9); 5.293(2.2); 3.321(17.1); 3.075(1.0); 2.671(0.4); 2.596(16.0); 2.503(58.2); 2.330(0.4); 2.075(0.5); 0.000(19.0)
75	1.47	1.5	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.350(3.2); 9.343(3.3); 9.287(5.6); 9.285(5.5); 8.681(2.1); 8.677(2.3); 8.669(2.3); 8.666(2.3); 8.522(1.2); 8.518(1.4); 8.515(1.4); 8.512(1.3); 8.501(1.3); 8.497(1.4); 8.495(1.5); 8.491(1.3); 7.978(3.7); 7.761(2.5); 7.738(2.9); 7.677(1.8); 7.665(1.7); 7.656(1.7); 7.644(1.7); 7.468(2.0); 7.465(2.0); 7.446(1.7); 7.442(1.8); 5.755(3.4); 3.319(22.1); 3.008(16.0); 2.987(1.3); 2.978(0.9); 2.970(0.7);

[1283]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
			2.960(0.4); 2.672(0.4); 2.525(0.7); 2.511(19.0); 2.507(38.5); 2.503(51.1); 2.498(37.7); 2.494(18.9); 0.561(1.8); 0.547(1.8); 0.458(2.1); 0.008(0.8); 0.000(23.7); -0.008(1.0)
76	1.62	2.84	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.375(4.2); 9.369(4.3); 9.309(7.2); 8.683(2.9); 8.680(3.1); 8.672(3.1); 8.669(3.1); 8.545(6.4); 8.534(1.8); 8.523(1.9); 8.519(2.0); 8.516(2.1); 8.513(1.7); 8.486(4.3); 8.473(4.4); 8.150(2.8); 8.146(2.7); 8.127(3.2); 8.123(3.1); 7.852(5.0); 7.850(5.1); 7.837(4.0); 7.814(3.4); 7.685(2.3); 7.673(2.2); 7.664(2.2); 7.652(2.1); 7.236(3.1); 7.232(3.1); 7.223(3.1); 7.219(3.0); 3.318(62.4); 3.232(2.2); 3.214(6.9); 3.195(7.1); 3.177(2.3); 2.676(0.6); 2.671(0.8); 2.667(0.6); 2.507(87.7); 2.502(113.3); 2.498(84.3); 2.333(0.6); 2.329(0.7); 2.325(0.5); 1.363(7.6); 1.345(16.0); 1.327(7.4); 1.259(0.4); 1.250(0.7); 1.230(0.6); 0.000(2.0)
77	2.53	1.93	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.364(3.9); 9.358(4.0); 9.306(6.8); 9.304(6.7); 8.682(2.8); 8.678(3.1); 8.670(3.0); 8.667(3.1); 8.534(1.6); 8.531(1.9); 8.528(1.8); 8.524(1.7); 8.514(1.8); 8.510(1.9); 8.507(2.0); 8.503(1.7); 8.461(3.0); 8.458(3.3); 8.450(3.3); 8.446(3.3); 7.989(4.8); 7.987(3.8); 7.883(2.7); 7.879(2.8); 7.862(3.0); 7.859(3.0); 7.819(3.3); 7.796(3.9); 7.685(2.2); 7.683(2.2); 7.673(2.1); 7.672(2.1); 7.664(2.1); 7.663(2.1); 7.652(2.1); 7.651(2.0); 7.564(3.4); 7.560(3.4); 7.541(2.9); 7.537(3.0); 7.396(3.2); 7.384(3.0); 7.376(2.9); 7.364(2.9); 5.754(2.5); 3.318(64.0); 2.983(2.1); 2.965(6.8); 2.947(6.9); 2.928(2.2); 2.676(0.5); 2.671(0.6); 2.667(0.5); 2.525(1.7); 2.520(2.7); 2.511(34.0); 2.507(69.0); 2.502(92.0); 2.498(68.4); 2.493(34.2); 2.334(0.4); 2.329(0.6); 2.324(0.4); 1.352(1.8); 1.336(1.3); 1.299(0.4); 1.259(0.7); 1.250(1.9); 1.232(1.8); 1.228(1.8); 1.208(7.6); 1.189(16.0); 1.171(7.3); 0.000(1.9)
79	3.57	3.57	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.375(3.2); 9.369(3.2); 9.347(6.5); 9.346(6.7); 8.683(2.3); 8.680(2.4); 8.671(2.4); 8.669(2.4); 8.549(5.0); 8.543(2.5); 8.539(2.1); 8.536(1.9); 8.533(1.7); 8.522(1.8); 8.518(1.9); 8.515(2.0); 8.512(1.6); 8.314(0.4); 8.157(2.7); 8.153(2.7); 8.134(3.1); 8.130(3.2); 7.866(3.7); 7.844(3.2); 7.788(1.7); 7.786(2.0); 7.769(4.7); 7.767(4.5); 7.751(3.8); 7.732(4.8); 7.713(1.9); 7.685(2.0); 7.673(2.0); 7.665(2.0); 7.652(1.9); 7.240(3.4); 7.238(3.7); 7.221(3.2); 7.219(3.4); 3.319(52.8); 3.305(2.4); 3.287(6.8); 3.268(6.9); 3.250(2.2); 2.891(0.5); 2.732(0.4); 2.676(0.6); 2.671(0.8); 2.667(0.6); 2.525(2.2); 2.511(45.8); 2.507(91.2); 2.502(119.4); 2.498(88.9); 2.494(44.6); 2.334(0.6); 2.329(0.8);

[1284]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
			2.325(0.6); 1.419(7.4); 1.401(16.0); 1.383(7.2); 1.232(0.3); 0.922(0.4); 0.146(0.5); 0.008(4.1); 0.000(106.0); -0.008(4.7); -0.150(0.5)
80	2.87	3.03	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.371(3.9); 9.365(3.9); 9.314(6.6); 8.681(2.7); 8.678(2.9); 8.669(2.8); 8.666(2.8); 8.618(3.8); 8.613(3.8); 8.540(1.6); 8.537(1.8); 8.534(1.7); 8.530(1.5); 8.513(6.5); 8.146(2.6); 8.142(2.4); 8.123(2.9); 8.119(2.9); 8.039(3.0); 8.018(3.9); 7.882(3.0); 7.876(2.9); 7.861(2.4); 7.855(2.4); 7.845(3.5); 7.822(3.0); 7.682(2.1); 7.671(2.0); 7.662(2.0); 7.650(2.0); 3.318(79.7); 3.113(2.3); 3.095(7.4); 3.076(7.5); 3.058(2.5); 2.676(0.6); 2.671(0.8); 2.667(0.6); 2.524(2.4); 2.511(45.8); 2.507(90.2); 2.502(117.9); 2.498(87.2); 2.493(44.0); 2.334(0.6); 2.329(0.8); 2.325(0.6); 1.352(0.9); 1.336(0.4); 1.295(7.8); 1.276(16.0); 1.258(7.8); 1.250(0.9); 1.232(1.0); 0.000(1.9)
81	3.15	3.12	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.967(3.6); 9.462(5.6); 9.448(0.4); 9.390(3.2); 9.384(3.3); 8.702(2.3); 8.699(2.5); 8.690(2.4); 8.687(2.5); 8.557(5.0); 8.539(1.5); 8.536(1.8); 8.533(1.9); 8.529(1.5); 7.921(1.4); 7.918(1.3); 7.899(2.6); 7.895(2.6); 7.851(3.5); 7.828(1.8); 7.698(1.8); 7.686(1.8); 7.678(1.8); 7.666(1.7); 7.571(5.2); 7.208(4.7); 4.038(0.4); 4.021(0.4); 3.892(1.1); 3.866(3.5); 3.840(3.6); 3.814(1.2); 3.317(32.3); 2.675(0.4); 2.671(0.5); 2.666(0.4); 2.524(1.5); 2.510(31.3); 2.506(61.7); 2.502(81.3); 2.497(60.7); 2.493(30.4); 2.385(14.2); 2.333(0.5); 2.329(0.6); 2.324(0.5); 2.226(16.0); 2.204(1.4); 2.185(0.9); 1.988(1.9); 1.193(0.5); 1.175(1.0); 1.158(0.5); 0.008(1.4); 0.000(38.9); -0.008(1.4)
82	3.22	3.15	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10.340(4.2); 9.465(6.6); 9.464(6.2); 9.390(3.5); 9.384(3.6); 8.705(2.5); 8.701(2.7); 8.693(2.6); 8.689(2.7); 8.559(1.5); 8.555(1.8); 8.552(1.7); 8.549(1.6); 8.538(6.1); 8.535(4.9); 8.528(1.7); 8.313(0.4); 8.005(3.7); 8.000(3.8); 7.907(1.4); 7.903(1.3); 7.884(3.8); 7.880(4.0); 7.861(4.6); 7.838(1.6); 7.718(2.0); 7.713(2.0); 7.699(3.3); 7.692(2.6); 7.689(2.5); 7.680(1.9); 7.668(1.9); 7.667(1.8); 7.278(3.1); 7.257(2.8); 3.916(1.4); 3.891(4.5); 3.865(4.7); 3.839(1.6); 3.316(37.0); 2.676(0.5); 2.671(0.7); 2.667(0.5); 2.524(2.1); 2.511(39.5); 2.506(79.7); 2.502(106.8); 2.497(80.0); 2.493(39.9); 2.370(16.0); 2.333(0.6); 2.329(0.8); 2.324(0.6); 1.988(0.8); 1.176(0.4); 0.008(1.6); 0.000(47.8); -0.009(1.7)
85	1.45	1.5	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.411(3.6); 9.366(1.8); 9.360(1.8); 8.700(0.5); 8.690(1.8); 8.687(2.2); 8.678(1.6); 8.675(1.7); 8.536(0.7);

[1285]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
			8.532(0.8); 8.529(0.8); 8.526(0.7); 8.515(0.8); 8.511(0.9); 8.508(0.9); 8.505(0.7); 8.377(2.5); 7.799(2.5); 7.795(3.6); 7.792(3.1); 7.686(1.0); 7.674(1.0); 7.665(0.9); 7.653(0.9); 3.514(0.7); 3.498(1.5); 3.480(1.5); 3.464(0.8); 3.319(45.1); 2.704(1.8); 2.685(2.5); 2.676(0.4); 2.668(1.8); 2.525(0.8); 2.511(17.8); 2.507(36.3); 2.502(48.0); 2.498(35.2); 2.493(17.3); 2.122(16.0); 0.008(0.6); 0.000(20.4); -0.008(0.8)
86	1.55	1.55	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.350(2.9); 9.344(3.1); 9.311(5.6); 8.687(2.3); 8.678(2.1); 8.675(2.3); 8.524(1.2); 8.520(1.5); 8.517(1.5); 8.514(1.4); 8.503(1.3); 8.499(1.5); 8.496(1.6); 8.493(1.4); 7.912(1.3); 7.826(2.6); 7.804(2.9); 7.683(1.7); 7.671(1.7); 7.662(1.7); 7.650(1.6); 7.366(1.0); 7.345(0.9); 6.295(0.6); 5.755(1.1); 3.893(0.7); 3.323(9.7); 3.088(16.0); 2.508(22.2); 2.504(30.2); 2.500(24.3); 0.000(5.7)
87	1.14	1.16	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.346(8.9); 9.340(9.0); 9.303(15.2); 9.302(16.0); 8.686(5.7); 8.683(6.4); 8.674(6.0); 8.671(6.4); 8.520(3.4); 8.517(3.9); 8.514(3.9); 8.510(3.5); 8.500(3.7); 8.496(3.9); 8.493(4.2); 8.489(3.6); 8.313(0.7); 7.896(11.8); 7.813(7.2); 7.790(8.0); 7.680(5.1); 7.668(4.9); 7.659(4.8); 7.647(4.6); 7.377(6.8); 7.373(7.0); 7.354(6.2); 7.351(6.5); 4.056(0.4); 4.038(1.2); 4.020(1.2); 4.003(0.4); 3.628(10.1); 3.548(4.7); 3.415(0.3); 3.355(0.4); 3.339(0.6); 3.315(198.6); 2.716(0.5); 2.675(1.4); 2.671(1.9); 2.666(1.4); 2.662(0.7); 2.565(0.4); 2.524(4.8); 2.510(94.3); 2.506(194.6); 2.501(267.1); 2.497(203.5); 2.493(103.2); 2.333(1.3); 2.328(1.8); 2.324(1.3); 1.988(5.2); 1.336(0.9); 1.299(0.3); 1.259(0.5); 1.250(1.2); 1.235(0.5); 1.193(1.4); 1.175(2.7); 1.157(1.3); 0.008(1.5); 0.000(50.0); -0.008(1.9)
88	1.43	1.48	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.412(0.3); 9.348(8.9); 9.342(9.0); 9.293(16.0); 9.291(15.5); 8.683(6.2); 8.679(6.7); 8.671(6.4); 8.668(6.6); 8.523(3.8); 8.519(4.4); 8.516(4.2); 8.512(3.7); 8.502(4.1); 8.498(4.4); 8.495(4.6); 8.492(3.8); 8.313(1.6); 8.005(12.2); 7.781(7.8); 7.758(9.0); 7.729(0.3); 7.678(5.1); 7.677(5.1); 7.667(5.0); 7.657(4.8); 7.646(4.7); 7.644(4.5); 7.481(7.9); 7.477(7.8); 7.459(6.7); 7.455(6.9); 7.183(0.4); 5.920(0.5); 5.753(1.0); 3.902(1.1); 3.503(10.8); 3.492(10.9); 3.371(0.3); 3.315(234.6); 2.675(2.4); 2.671(3.3); 2.666(2.5); 2.595(0.5); 2.524(9.5); 2.511(169.3); 2.506(342.2); 2.502(458.1); 2.497(343.6); 2.493(171.5); 2.333(2.1); 2.328(2.9); 2.324(2.1); 2.043(0.5); 2.009(0.5); 1.898(4.5); 1.883(4.8); 1.865(3.8); 1.848(4.9); 1.833(4.5); 1.352(0.6); 1.336(4.4); 1.298(2.0); 1.259(3.1); 1.250(6.1); 1.235(2.8); 1.188(0.4); 0.854(0.5);

[1286]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
			0.146(1.1); 0.016(0.8); 0.008(9.3); 0.000(270.2); -0.009(9.9); -0.150(1.1)
89	1.63	1.65	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.342(8.9); 9.336(8.9); 9.271(15.2); 9.270(16.0); 8.682(5.9); 8.678(6.6); 8.670(6.2); 8.667(6.5); 8.517(3.5); 8.513(4.1); 8.511(4.0); 8.507(3.6); 8.496(3.8); 8.493(4.1); 8.490(4.4); 8.486(3.6); 8.314(0.5); 7.834(0.5); 7.804(15.5); 7.803(15.6); 7.779(8.1); 7.676(5.1); 7.665(4.9); 7.656(4.8); 7.644(4.7); 7.307(6.9); 7.303(6.7); 7.285(6.1); 7.281(6.5); 4.303(0.5); 3.671(0.9); 3.375(2.5); 3.356(2.5); 3.345(2.4); 3.335(2.4); 3.317(58.3); 2.676(0.7); 2.671(0.9); 2.667(0.7); 2.524(2.8); 2.507(106.2); 2.502(142.9); 2.498(108.9); 2.494(56.1); 2.466(0.5); 2.463(0.5); 2.334(0.7); 2.329(1.0); 2.325(0.7); 1.336(1.0); 1.299(0.5); 1.259(0.7); 1.250(1.4); 1.233(0.7); 1.214(0.5); 1.197(0.9); 1.134(11.3); 0.146(0.8); 0.008(6.0); 0.000(158.8); -0.008(7.1); -0.150(0.8)
90	1.84	1.87	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.348(3.5); 9.342(3.5); 9.313(5.9); 8.693(2.4); 8.690(2.6); 8.681(2.5); 8.678(2.5); 8.524(1.4); 8.521(1.7); 8.518(1.6); 8.514(1.4); 8.503(1.5); 8.500(1.7); 8.497(1.7); 8.493(1.4); 7.940(2.4); 7.840(2.9); 7.817(3.1); 7.685(1.9); 7.674(1.9); 7.665(1.9); 7.653(1.8); 7.368(1.6); 7.345(1.5); 4.425(0.4); 4.378(1.0); 4.361(1.0); 3.318(44.4); 3.143(0.4); 3.121(16.0); 2.672(0.5); 2.667(0.4); 2.507(59.1); 2.502(76.5); 2.498(57.7); 2.333(0.4); 2.329(0.5); 2.325(0.4); 0.000(2.5)
91	3.22	3.12	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10.202(4.5); 9.474(6.5); 9.389(3.7); 9.383(3.8); 8.704(2.5); 8.701(2.8); 8.693(2.7); 8.689(2.8); 8.576(4.5); 8.560(1.6); 8.556(1.8); 8.554(1.8); 8.550(1.6); 8.539(1.6); 8.536(1.8); 8.533(1.9); 8.529(1.6); 8.313(0.3); 7.913(1.5); 7.909(1.5); 7.890(3.4); 7.886(3.6); 7.857(4.3); 7.844(3.4); 7.834(2.3); 7.824(3.3); 7.699(2.0); 7.687(2.0); 7.678(2.0); 7.667(1.9); 7.313(2.8); 7.284(2.8); 3.918(1.4); 3.892(4.3); 3.866(4.5); 3.840(1.6); 3.317(33.8); 2.676(0.3); 2.671(0.5); 2.667(0.4); 2.511(26.0); 2.507(51.7); 2.502(70.1); 2.498(55.4); 2.465(0.6); 2.429(16.0); 2.333(0.4); 2.329(0.5); 2.324(0.4); 0.008(0.5); 0.000(11.8)
92	1.5	1.58	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.346(9.8); 9.340(10.0); 9.293(16.0); 8.682(7.3); 8.670(7.1); 8.514(4.9); 8.493(5.0); 8.311(0.6); 7.883(13.3); 7.810(7.4); 7.788(8.0); 7.678(5.0); 7.666(5.2); 7.657(5.0); 7.645(4.5); 7.352(7.3); 7.329(6.6); 4.056(0.6); 4.039(1.6); 4.021(1.7); 4.003(0.7); 3.768(4.7); 3.626(0.5); 3.308(53.9); 2.671(15.8); 2.501(307.4); 2.328(2.0); 1.988(6.2); 1.193(1.7); 1.176(3.3); 1.158(1.7); 0.000(15.5)
93	0.87	1.03	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.353(9.2);

[1287]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
			9.346(9.3); 9.323(16.0); 8.690(5.9); 8.687(6.8); 8.678(6.2); 8.675(6.7); 8.526(3.2); 8.523(3.9); 8.520(4.0); 8.516(3.5); 8.505(3.5); 8.502(3.9); 8.499(4.3); 8.495(3.6); 8.310(0.7); 8.014(12.3); 7.829(7.1); 7.807(8.0); 7.683(5.1); 7.671(4.9); 7.662(4.8); 7.650(4.7); 7.457(0.4); 7.442(6.5); 7.439(6.9); 7.420(5.8); 7.417(6.3); 4.056(1.0); 4.050(0.8); 4.039(2.5); 4.021(2.6); 4.003(1.4); 3.920(4.2); 3.793(0.4); 3.322(349.3); 3.294(11.0); 3.282(12.9); 2.722(0.4); 2.675(1.1); 2.671(1.6); 2.666(1.3); 2.524(3.9); 2.506(186.6); 2.502(251.0); 2.497(188.8); 2.333(1.1); 2.328(1.6); 2.324(1.2); 1.988(9.0); 1.193(2.4); 1.176(4.6); 1.158(2.3); 0.008(0.4); 0.000(13.4)
94	2.23	2.23	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10.618(4.2); 9.478(6.2); 9.394(3.7); 9.387(3.8); 8.706(2.5); 8.703(2.8); 8.695(2.7); 8.691(2.9); 8.600(4.5); 8.563(1.4); 8.560(1.7); 8.557(1.6); 8.553(1.5); 8.543(1.6); 8.539(1.7); 8.536(1.8); 8.532(1.5); 8.373(3.9); 8.368(4.2); 8.314(0.3); 8.000(1.9); 7.995(1.9); 7.980(2.1); 7.974(2.1); 7.940(1.7); 7.936(1.8); 7.917(3.3); 7.913(3.5); 7.869(4.0); 7.847(2.1); 7.703(2.0); 7.691(1.9); 7.682(1.9); 7.670(1.9); 7.367(3.0); 7.346(2.8); 4.181(1.0); 4.171(0.5); 4.153(1.1); 4.143(1.3); 4.126(0.5); 4.116(1.3); 4.089(0.4); 3.949(0.3); 3.922(1.2); 3.913(0.4); 3.895(1.4); 3.885(1.1); 3.868(0.5); 3.858(1.0); 3.832(0.3); 3.318(50.7); 2.791(0.6); 2.676(0.6); 2.671(0.8); 2.667(0.6); 2.635(0.5); 2.524(2.4); 2.511(44.9); 2.507(91.6); 2.502(122.3); 2.497(92.4); 2.493(47.8); 2.351(16.0); 2.333(0.9); 2.329(1.0); 2.324(0.8); 1.336(0.7); 1.299(0.5); 1.259(0.8); 1.250(1.0); 1.234(0.5); 0.146(0.6); 0.008(5.1); 0.000(138.3); -0.008(6.3); -0.150(0.6)
95	0.9	0.95	
96	2.19	2.14	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10.415(4.3); 9.488(6.7); 9.391(3.8); 9.385(3.8); 8.707(2.8); 8.704(2.7); 8.695(2.8); 8.692(2.7); 8.598(4.7); 8.562(1.5); 8.558(1.8); 8.556(1.7); 8.552(1.4); 8.541(1.6); 8.538(1.8); 8.535(1.8); 8.531(1.4); 8.314(0.4); 8.167(3.2); 8.148(3.2); 7.923(1.5); 7.920(1.4); 7.900(3.6); 7.897(3.5); 7.870(4.4); 7.847(1.8); 7.703(2.1); 7.691(2.0); 7.682(2.0); 7.670(1.9); 7.413(2.7); 7.385(2.7); 5.754(0.5); 4.238(0.9); 4.229(0.5); 4.211(1.1); 4.201(1.3); 4.183(0.5); 4.174(1.3); 4.147(0.4); 4.055(0.4); 4.029(1.2); 4.020(0.4); 4.002(1.4); 3.992(1.0); 3.974(0.5); 3.965(1.0); 3.317(62.0); 2.671(1.7); 2.557(0.4); 2.524(3.1); 2.506(119.8); 2.502(153.5); 2.497(112.4); 2.399(16.0); 2.333(0.7); 2.328(1.0); 2.324(0.7); 1.909(3.4); 1.235(0.9); 0.146(1.0); 0.008(8.2); 0.000(206.2); -0.008(8.5); -0.025(0.4); -0.150(1.0)
97	2.2	2.22	¹ H-NMR(601.6 MHz, DMF): δ= 10.128(0.3);

[1288]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
			9.505(1.0); 9.504(0.9); 9.455(0.5); 9.451(0.5); 8.740(0.4); 8.738(0.4); 8.732(0.4); 8.730(0.4); 8.705(0.7); 8.091(1.0); 8.052(0.4); 8.049(0.4); 8.037(0.7); 8.034(0.7); 8.024(5.2); 7.906(0.6); 7.891(0.5); 7.326(0.8); 3.465(16.0); 2.921(2.9); 2.918(5.7); 2.915(8.1); 2.912(5.6); 2.909(2.7); 2.751(3.1); 2.747(6.3); 2.744(9.0); 2.741(6.3); 2.738(3.1); 2.438(3.0); 2.433(2.9); 0.005(0.5); 0.000(12.7); -0.006(0.4)
98	1.27	1.30	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 12.941(2.9); 9.350(9.6); 9.344(9.6); 9.136(16.0); 8.655(6.5); 8.652(7.1); 8.643(6.8); 8.640(7.0); 8.510(3.7); 8.507(4.5); 8.505(4.5); 8.501(3.8); 8.490(4.0); 8.486(4.6); 8.484(4.8); 8.480(3.8); 8.314(0.7); 8.257(4.7); 8.007(4.6); 7.951(12.7); 7.755(5.7); 7.732(9.9); 7.676(8.2); 7.673(8.3); 7.662(5.6); 7.650(9.7); 7.641(5.2); 7.629(4.7); 3.321(105.7); 2.891(0.4); 2.732(0.4); 2.672(1.3); 2.507(159.7); 2.503(205.5); 2.498(160.5); 2.329(1.3); 0.000(5.4)
99	2.12	2.12	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.356(8.4); 9.350(8.8); 9.175(14.9); 8.661(6.6); 8.649(6.7); 8.513(4.1); 8.492(4.4); 8.349(15.0); 8.139(16.0); 7.998(11.7); 7.786(6.0); 7.763(8.2); 7.667(4.5); 7.655(4.9); 7.646(11.1); 7.635(4.8); 7.623(5.3); 5.206(2.9); 5.183(9.2); 5.160(9.6); 5.137(3.3); 3.323(45.8); 2.673(0.7); 2.504(114.3); 2.330(0.7); 1.990(0.9); 1.176(0.5); 0.146(0.6); 0.000(109.6); -0.150(0.6)
101	2.04	2.21	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.382(9.7); 9.375(9.6); 9.348(16.0); 8.730(5.1); 8.716(5.4); 8.707(5.3); 8.693(5.9); 8.688(7.0); 8.685(7.1); 8.676(6.8); 8.673(6.8); 8.608(11.3); 8.551(3.6); 8.548(4.2); 8.545(4.1); 8.541(3.6); 8.531(3.9); 8.527(4.2); 8.524(4.4); 8.521(3.6); 8.315(0.4); 8.186(6.1); 8.182(5.9); 8.163(7.0); 8.159(6.9); 8.045(5.1); 8.040(5.2); 8.017(5.3); 8.011(5.0); 7.859(8.5); 7.836(7.4); 7.686(5.0); 7.674(4.9); 7.665(4.8); 7.653(4.7); 7.310(3.2); 7.304(3.0); 7.296(3.3); 7.289(4.8); 7.283(3.0); 7.275(3.2); 7.269(2.8); 3.324(78.0); 3.322(83.3); 2.677(0.6); 2.673(0.8); 2.668(0.6); 2.508(103.2); 2.504(133.3); 2.499(96.6); 2.335(0.6); 2.331(0.8); 2.326(0.6); 0.008(2.0); 0.000(50.1); -0.008(2.0)
104	2.4	2.44	

[1289] 生物实施例

[1290] 桃蚜 (*Myzus persicae*) -喷雾试验

[1291] 溶剂:78重量份的丙酮

[1292] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[1293] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[1294] 为制备合适的活性化合物制剂,用所述重量份的溶剂溶解1重量份的活性化合物,并用含浓度为1000ppm的乳化剂的水补充直至获得所需浓度。为制备其他试验浓度,用含乳化剂的水稀释该制剂。

[1295] 用所需浓度的活性化合物制剂喷洒被所有阶段的桃蚜 (*Myzus persicae*) 侵染的大白菜 (*Brassica pekinensis*) 的叶盘。

[1296] 6天后,测定以%计的功效。100%意指所有蚜虫已被杀死;0%意指没有蚜虫被杀死。

[1297] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在500g/ha的施用率下表现出100%的功效:1、3、5、7、16、24、30、32、33、50、52、61、67、68、69、74、79、80、86、87、88、89、92、96、97、108、109、112、115、121、122、128。

[1298] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在500g/ha的施用率下表现出90%的功效:4、6、8、9、10、11、13、14、15、18、19、20、22、25、27、31、37、49、51、53、54、55、56、57、58、60、62、63、64、65、66、71、73、75、76、77、81、82、85、90、94、95、99、101、104、105、110、111、113、114、116、118、123、124、126、129、130。

[1299] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100g/ha的施用率下表现出100%的功效:23。

[1300] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在100g/ha的施用率下表现出90%的功效:26、29、59、91。

[1301] 桃蚜-喷雾试验

[1302] 溶剂:7重量份的二甲基甲酰胺

[1303] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[1304] 为制备合适的活性化合物制剂,用所述重量份的溶剂溶解1重量份的活性化合物,并用含浓度为1000ppm的乳化剂的水补充直至获得所需浓度。为制备其他试验浓度,用含乳化剂的水稀释该制剂。如果需要添加铵盐或/和渗透剂,则将它们各自以1000ppm的浓度添加至制剂溶液中。

[1305] 通过喷洒所需浓度的活性化合物制剂来处理被桃蚜 (*Myzus persicae*) 严重侵染的甜椒 (*Capsicum annuum*) 植株。

[1306] 6天后,测定以%计的杀死率。100%意指所有蚜虫已被杀死;0%意指没有蚜虫被杀死。

[1307] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在4ppm的施用率下表现出100%的功效:51。

[1308] 辣根猿叶甲 (*Phaedon cochleariae*)-喷雾试验

[1309] 溶剂:78.0重量份的丙酮

[1310] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[1311] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[1312] 为制备合适的活性化合物制剂,用所述重量份的溶剂溶解1重量份的活性化合物,并用含浓度为1000ppm的乳化剂的水补充直至获得所需浓度。为制备其他试验浓度,用含乳化剂的水稀释该制剂。

[1313] 用所需浓度的活性化合物制剂喷洒大白菜 (*Brassica pekinensis*) 的叶盘,并在干燥后接种芥菜甲虫 (辣根猿叶甲 (*Phaedon cochleariae*)) 的幼虫。

[1314] 7天后,测定以%计的功效。100%意指所有甲虫幼虫已被杀死;0%意指没有甲虫幼虫被杀死。

[1315] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在500g/ha的施用率下表现出100%的功效:16、38。

[1316] 草地贪夜蛾 (Spodoptera frugiperda) -喷雾试验

[1317] 溶剂:78.0重量份的丙酮

[1318] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[1319] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[1320] 为制备合适的活性化合物制剂,用所述重量份的溶剂溶解1重量份的活性化合物,并用含浓度为1000ppm的乳化剂的水补充直至获得所需浓度。为制备其他试验浓度,用含乳化剂的水稀释该制剂。

[1321] 用所需浓度的活性化合物制剂喷洒玉米 (*Zea mays*) 的叶盘,并在干燥后接种粘虫 (草地贪夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*)) 的毛虫。

[1322] 7天后,测定以%计的功效。100%意指所有毛虫已被杀死;0%意指没有毛虫被杀死。

[1323] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在500g/ha的施用率下表现出100%的功效:38。

[1324] 二斑叶螨 (Tetranychus urticae) -喷雾试验,OP-抗性

[1325] 溶剂:78.0重量份的丙酮

[1326] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[1327] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[1328] 为制备合适的活性化合物制剂,用所述重量份的溶剂溶解1重量份的活性化合物,并用含浓度为1000ppm的乳化剂的水补充直至获得所需浓度。为制备其他试验浓度,用含乳化剂的水稀释该制剂。

[1329] 用所需浓度的活性化合物制剂喷洒被所有阶段的温室红叶螨 (greenhouse red spider mite) (二斑叶螨 (*Tetranychus urticae*)) 侵染的菜豆 (*Phaseolus vulgaris*) 的叶盘。

[1330] 6天后,测定以%计的功效。100%意指所有叶螨已被杀死;0%意指没有叶螨被杀死。

[1331] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在500g/ha的施用率下表现出90%的功效:117。

[1332] 棉蚜 (Aphis gossypii) -喷雾试验

[1333] 溶剂:7重量份的二甲基甲酰胺

[1334] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[1335] 为制备合适的活性化合物制剂,用所述重量份的溶剂溶解1重量份的活性化合物,并用含浓度为1000ppm的乳化剂的水补充直至获得所需浓度。为制备其他试验浓度,用含乳化剂的水稀释该制剂。如果需要添加铵盐或/和渗透剂,则将它们各自以1000ppm的浓度添加至制剂溶液中。

[1336] 用所需浓度的活性化合物制剂喷洒被棉蚜 (*Aphis gossypii*) 严重侵染的棉 (*Gossypium hirsutum*) 植株。

[1337] 6天后,测定以%计的杀死率。100%意指所有蚜虫已被杀死;0%意指没有蚜虫被

杀死。

[1338] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在4ppm的施用率下表现出80%的功效:12。

[1339] 微小牛蜱 (Boophilus microplus) -注射试验

[1340] 溶剂:二甲基亚砷

[1341] 为制备合适的活性化合物制剂,将10mg活性化合物与0.5ml溶剂混合,并将该浓缩物用溶剂稀释至所需浓度。

[1342] 将1 μ l活性化合物溶液注射至5只过饱的成年雌牛蜱(微小牛蜱 (*Boophilus microplus*))的腹部。将所述动物转移至培养皿中,并保持在温控室中。

[1343] 7天后,通过受精卵的产卵数来评估功效。将能育性不可外部目测的卵储存在温控箱中,直到约42天后幼虫孵化出来。100%功效意指没有牛蜱产下任何受精卵;0%意指所有的卵均具有能育性。

[1344] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在20 μ g/动物的施用率下表现出100%的功效:52。

[1345] 短古柏线虫 (Cooperia curticei) -试验

[1346] 溶剂:二甲基亚砷

[1347] 为制备合适的活性化合物制剂,将10mg活性化合物与0.5ml二甲基亚砷混合,并将该浓缩物用“Ringer溶液”稀释至所需浓度。

[1348] 将含有所需浓度的活性化合物制剂的容器接种约40只线虫幼虫(短古柏线虫 (*Cooperia curticei*))。

[1349] 5天后,测定以%计的杀死率。100%意指所有幼虫已被杀死;0%意指没有幼虫被杀死。

[1350] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在20ppm的施用率下表现出90%的功效:56、65。

[1351] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在20ppm的施用率下表现出80%的功效:57、67、76。

[1352] 捻转血矛线虫 (Haemonchus contortus) -试验

[1353] 溶剂:二甲基亚砷

[1354] 为制备合适的活性化合物制剂,将10mg活性化合物与0.5ml二甲基亚砷混合,并将该浓缩物用“Ringer溶液”稀释至所需浓度。

[1355] 将含有所需浓度的活性化合物制剂的容器接种约40只红色胃虫(捻转血矛线虫 (*Haemonchus contortus*))的幼虫。

[1356] 5天后,测定以%计的杀死率。100%意指所有幼虫已被杀死;0%意指没有幼虫被杀死。

[1357] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在20ppm的施用率下表现出80%的功效:65、67。

[1358] 南方根结线虫 (Meloidogyne incognita) -试验

[1359] 溶剂:125.0重量份的丙酮

[1360] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物与所述量的溶剂混合,并

将该浓缩物用水稀释至所需浓度。

[1361] 在容器内装入沙子、活性化合物溶液、南方根结线虫 (*Meloidogyne incognita*) 的卵/幼虫的悬浮液和莴苣种子。莴苣种子发芽,并长成植物。虫瘿在根部发育。

[1362] 14天后,通过形成的虫瘿形成测定以%计的杀线虫功效。100%意指未发现虫瘿;0%意指经处理的植物上的虫瘿数量与未经处理的对照组相当。

[1363] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在20ppm的施用率下表现出90%的功效:99、104。