



(12)发明专利申请

(10)申请公布号 CN 107207497 A

(43)申请公布日 2017.09.26

(21)申请号 201580075199.7

(22)申请日 2015.11.30

(30)优先权数据

14195948.6 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/EP2015/078056 2015.11.30

(87)PCT国际申请的公布数据

W02016/087368 DE 2016.06.09

(71)申请人 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 471/04(2006.01)

A01P 7/02(2006.01)

A01P 7/04(2006.01)

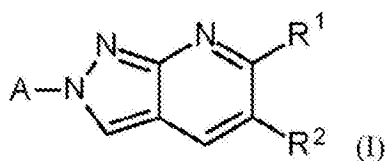
权利要求书12页 说明书111页

(54)发明名称

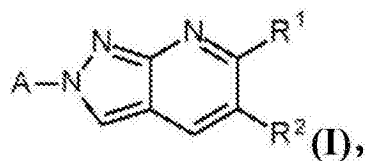
作为害虫防治剂的双环化合物

(57)摘要

本发明涉及新的式(I)的双环化合物、包含所述化合物的试剂,以及其用于防治动物害虫的用途和用于其制备的中间产物。

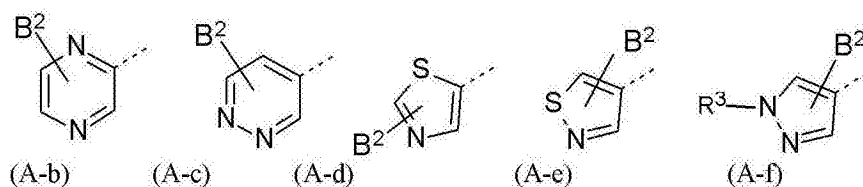
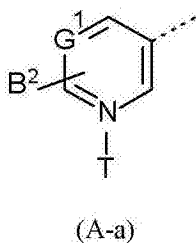


1. 式 (I) 的化合物



其中

A 是选自 (A-a) 至 (A-f) 的基团



其中虚线表示与式 (I) 的双环体系的氮原子连接的键, 且

G^1 是 N 或 $C-B^1$,

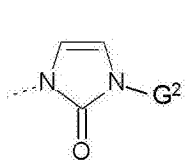
B^1 是选自以下的基团: 氢、卤素、氰基、硝基、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基以及在每种情况下任选取代的环烷基和环烯基,

B^2 是选自以下的基团: 氢、卤素、氰基、硝基、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基以及在每种情况下任选取代的环烷基和环烯基,

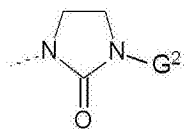
T 是氧或电子对,

R^1 是选自以下的基团: 氢、烷基、烷氧基和氰基,

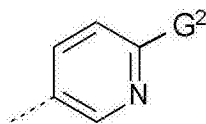
R^2 是选自 (B-1) 至 (B-36) 的 B 基团



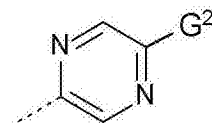
(B-29)



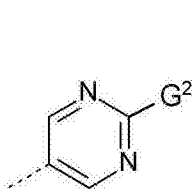
(B-30)



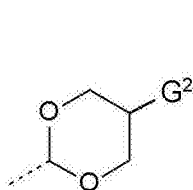
(B-31)



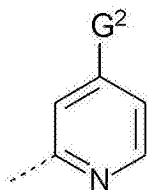
(B-32)



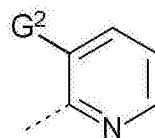
(B-33)



(B-34)

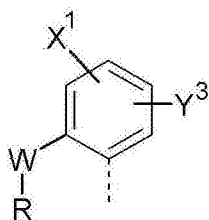


(B-35)

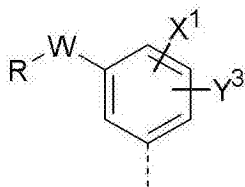


(B-36)

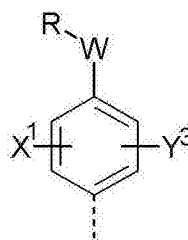
其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者
R^{2b}是选自(D-1)至(D-3)的D基团



(D-1)

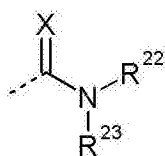


(D-2)

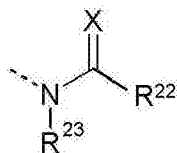


(D-3)

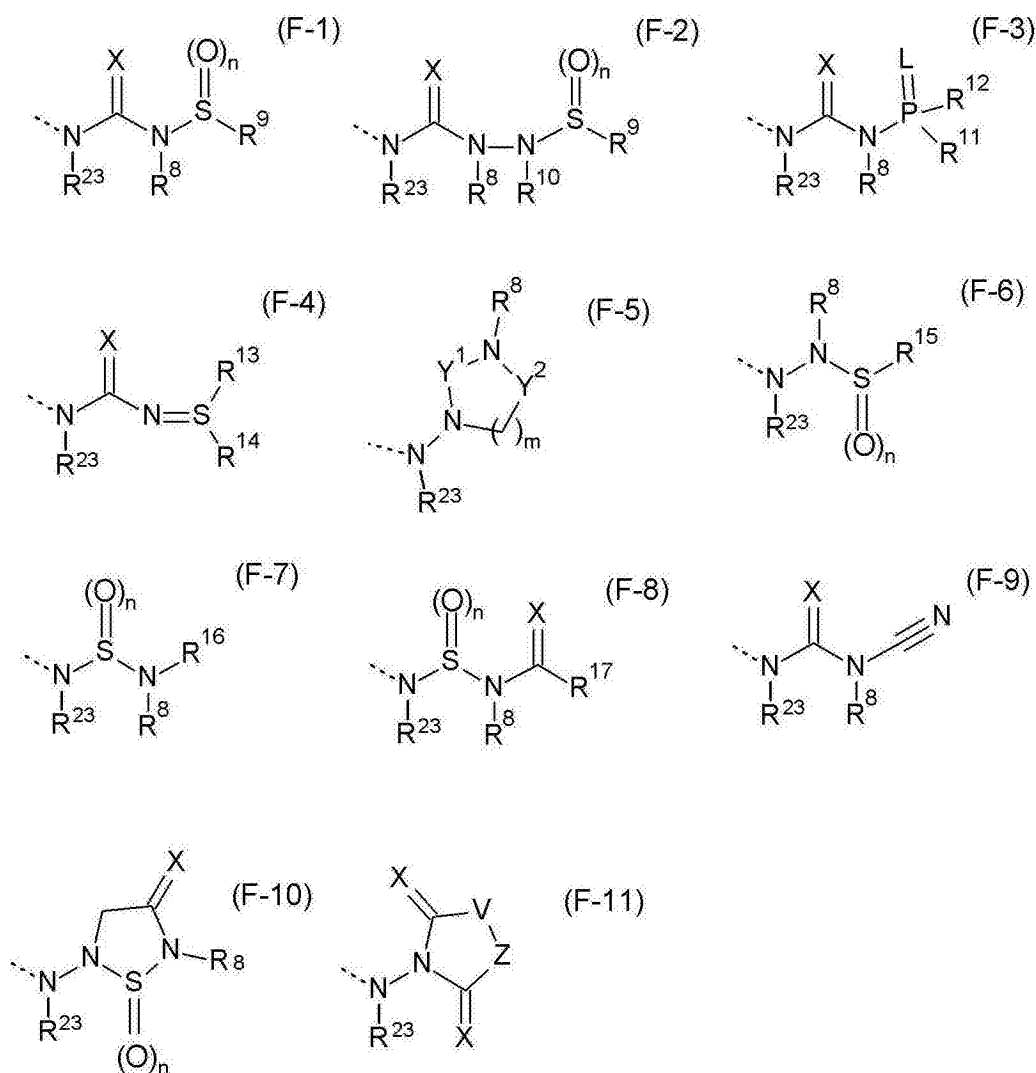
其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者
R^{2c}是下式的基团



其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者
R^{2d}是下式的基团



其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者
R^{2e}是选自(F-1)至(F-11)的F基团



其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者

R^{2f}是选自以下的基团:卤代烷基、羧基和氨基,

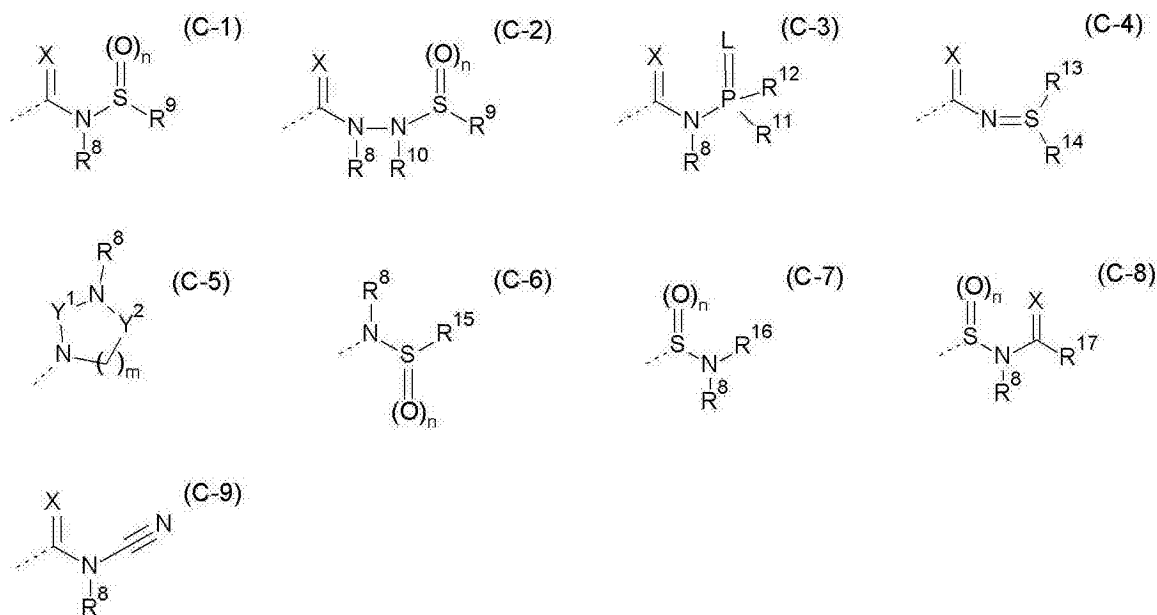
其中

G²是氢或选自以下的基团: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隔的饱和或不饱和环烷基、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、双(烷氧基)烷基、双(卤代烷氧基)烷基、烷氧基(烷硫基)烷基、烷氧基(烷基亚磺酰基)烷基、烷氧基(烷基磺酰基)烷基、双(烷硫基)烷基、双(卤代烷硫基)烷基、双(羟基烷硫基)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、杂环基基团二氧杂环己烷基、二氧杂环戊烷基、二氧杂环庚烷基、二氧杂环辛烷基、氧硫杂环己烷基、氧硫杂环戊烷基、氧硫杂环庚烷基、氧硫杂环辛烷基、二硫杂环己烷基、二硫杂环戊烷基、二硫杂环庚烷基、二硫杂环辛烷基、氧化氧硫杂环己烷基、氧化氧硫杂环戊烷基、氧化氧硫杂环庚烷基、氧化氧硫杂环辛烷基、二氧化氧硫杂环己烷基、二氧化氧硫杂环戊烷基、二氧化氧硫杂环庚烷基、二氧化氧硫杂环辛烷基、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、二氢噁唑基和吡唑啉酮基(对于这些基

团,其可又被烷基、卤代烷基、烷氧基和烷氧基烷基取代),苯基(对于该基团,其可又被卤素、氰基、硝基、烷基和卤代烷基取代),杂芳基基团吡啶基、N-氧化吡啶基、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(对于这些基团,其可又被卤素、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(对于这些基团,其可又被卤素和烷基取代),

或者

G²是选自(C-1)至(C-9)的基团



其中虚线表示与基团(B-1)至(B-34)连接的键,

X是氧或硫,

X¹是选自以下的基团: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,

X²是氧、硫、NR⁵或NOH,

L是氧或硫,

V-Z是R²⁴CH-CHR²⁵或R²⁴C=CR²⁵,

n是1或2,

m是1、2、3或4,

R是NR¹⁸R¹⁹,或是选自以下的在每种情况下任选取代的基团: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,

R³是氢或烷基,

R⁴是选自以下的基团: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,

R⁵是选自以下的基团: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

R^3 和 R^4 与它们所键合的氮原子一起形成环,该环可含有一个或多个选自氮、氧和硫的其他杂原子,或者

R^3 和 R^5 与它们所键合的氮原子一起形成环,

R^6 是氢或烷基,

R^7 是选自以下的基团: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

R^6 和 R^7 与它们所键合的氮原子一起形成环,该环可含有一个或多个选自氮、氧和硫的其他杂原子,

R^8 是选自以下的基团: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,在每种情况下任选卤素-取代的烷基羰基和烷基磺酰基,任选卤素-取代的烷氧基羰基,任选卤素-、烷基-、烷氧基-、卤代烷基-和氰基-取代的环烷基羰基,或者是阳离子或任选烷基-或芳基烷基-取代的铵离子,

R^9 是选自以下的基团:在每种情况下任选取代的烷基、烯基和炔基,在每种情况下任选取代的环烷基、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,在每种情况下任选取代的芳基、杂芳基、芳基烷基和杂芳基烷基,以及任选取代的氨基,

(C-1)和(F-1)基团中的 R^8 和 R^9 与它们所键合的N-S(O)_n基团一起还可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,

R^{10} 是氢或烷基,

(C-2)和(F-2)基团中的 R^8 和 R^{10} 与它们所键合的氮原子一起还可以是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,

(C-2)和(F-2)基团中的 R^9 和 R^{10} 与它们所键合的N-S(O)_n基团一起还可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,

R^{11} 是选自以下的在每种情况下任选取代的基团: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,

R^{12} 是选自以下的在每种情况下任选取代的基团: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,

(C-3)和(F-3)基团中的 R^{11} 和 R^{12} 与它们所键合的磷原子一起还可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,

R^{13} 是选自以下的在每种情况下任选取代的基团:烷基、烯基、炔基、苯基和苯基烷基,

R^{14} 是选自以下的在每种情况下任选取代的基团:烷基、烯基、炔基、苯基和苯基烷基,

R^{15} 是选自以下的基团:在每种情况下任选取代的烷基、烯基和炔基,在每种情况下任选取代的环烷基、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,在每种情况下任选取代的芳基、杂芳基、芳基烷基和杂芳基烷基,以及任选取代的氨基,

(C-6)和(F-6)基团中的 R^8 和 R^{15} 与它们所键合的N-S(O)_n基团一起还可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,

R^{16} 是选自以下的基团:氢,在每种情况下任选取代的烷基、烷氧基、烯基和炔基,在每种情况下任选取代的环烷基、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,在每种情况下任选取代的芳基、杂芳基、芳基烷基和杂芳基烷基,以及任选取代的氨基,

(C-7)和(F-7)基团中的 R^8 和 R^{16} 与它们所键合的氮原子一起还可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,

R^{17} 是选自以下的基团:在每种情况下任选取代的烷基、烷氧基、烯基和炔基,在每种情况下任选取代的环烷基、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,在每种情况下任选取代的芳基、杂芳基、芳基烷基和杂芳基烷基,以及任选取代的氨基,

(C-8)和(F-8)基团中的 R^8 和 R^{17} 与它们所键合的N-C(X)基团一起还可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,

R^{18} 是选自以下的基团:氢,羟基,在每种情况下任选取代的烷基、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,在每种情况下任选取代的环烷基、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,在每种情况下任选取代的芳基、芳基烷基、杂芳基和杂芳基烷基,以及任选取代的氨基,

R^{19} 是选自氢的基团,是碱金属或碱土金属离子,或是任选被C₁-C₄-烷基单-至四取代的铵离子,或是在每种情况下任选卤素-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、烷基磺酰基烷基基团,

Y^1 和 Y^2 独立地是C=O或S(O)₂,

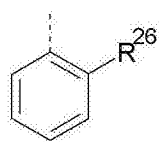
Y^3 是选自以下的基团:氢、卤素、氰基、烷基、环烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基和NR²⁰R²¹,

W是选自以下的基团:O、S、SO和SO₂,

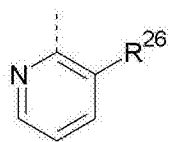
R^{22} 是选自以下的基团:烷基,任选卤素-、氨基甲酰基-、硫代氨基甲酰基-或氰基-取代的环烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷氧基烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷硫基、卤代烷基亚磺酰基、卤代烷基磺酰基、烷硫基烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基、烷硫基烷氧基、烷基亚磺酰基烷氧基、烷基磺酰基烷氧基、卤代烷硫基烷基、卤代烷基亚磺酰基烷基、卤代烷基磺酰基烷基、烷硫基烯基、烷基亚磺酰基烯基、烷基磺酰基烯基、烯硫基烷基、烯基亚磺酰基烷基、烯基磺酰基烷基、烷基羰基烷基、卤代烷基羰基烷基

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,或者在 $R^2=d$)的情况下,

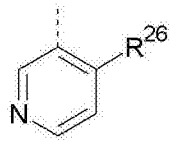
R^{22} 还是任选取代的芳基或选自E-1至E-51的基团



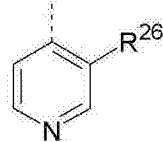
E-1



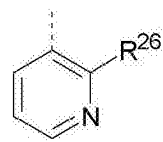
E-2



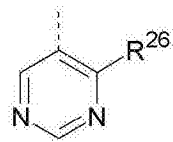
E-3



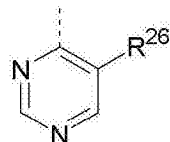
E-4



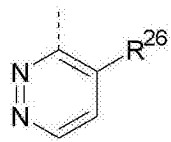
E-5



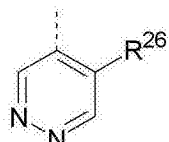
E-6



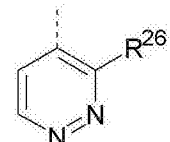
E-7



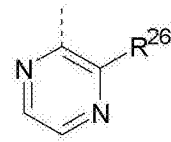
E-8



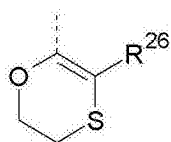
E-9



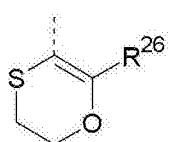
E-10



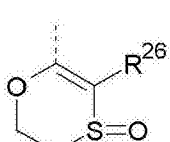
E-11



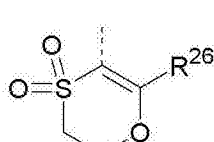
E-12



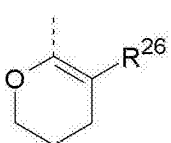
E-13



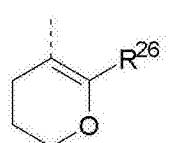
E-14



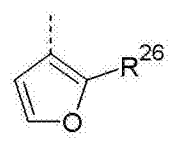
E-15



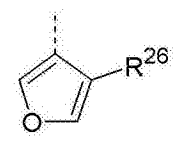
E-16



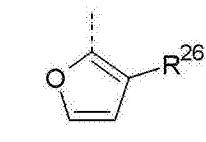
E-17



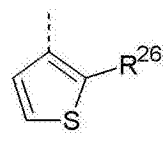
E-18



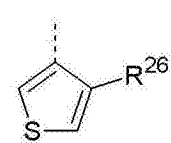
E-19



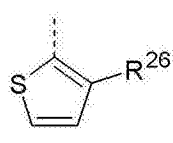
E-20



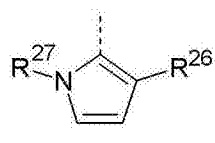
E-21



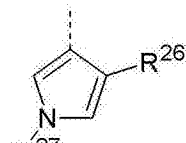
E-22



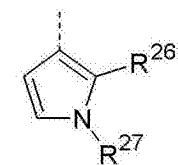
E-23



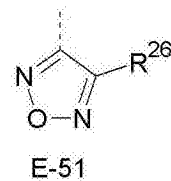
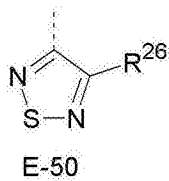
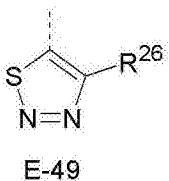
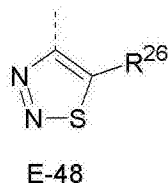
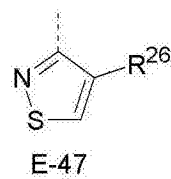
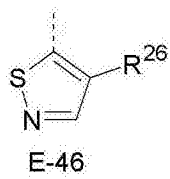
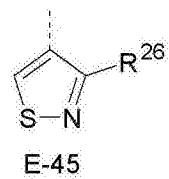
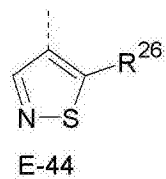
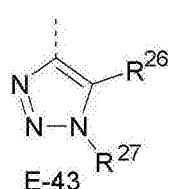
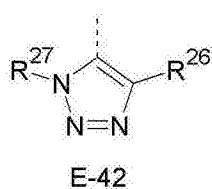
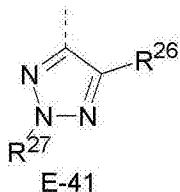
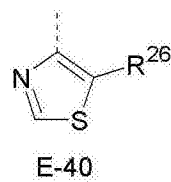
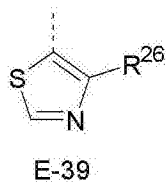
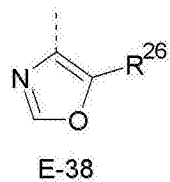
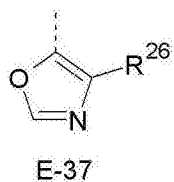
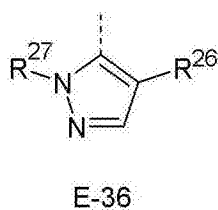
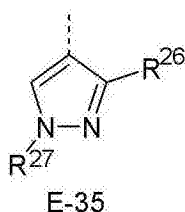
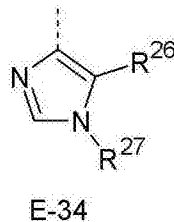
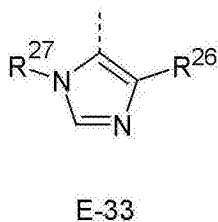
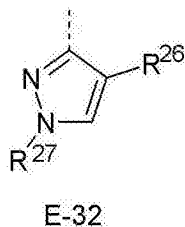
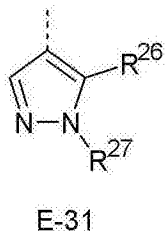
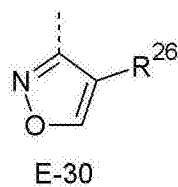
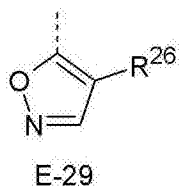
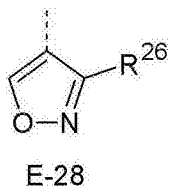
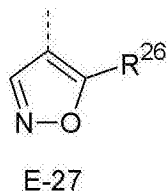
E-24



E-25



E-26



R^{20} 是选自以下的基团:氢、卤素、氰基、硝基、氨基、羟基,和在每种情况下任选取代的烷基、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、烷基羰氧基、烯基羰氧基、炔基羰氧基、环烷基羰氧基、烷氧基羰氧基、烷基磺酰氧基、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,

R^{21} 是选自以下的基团: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,

R^{23} 是选自以下的基团: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

R^{24} 是氢或选自以下的在每种情况下任选取代的基团:烷基、烯基、炔基、苯基和苯基烷基,且

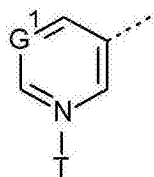
R^{25} 是氢或选自以下的在每种情况下任选取代的基团:烷基、烯基、炔基、苯基和苯基烷基,

R^{27} 是氢或烷基,且

R^{26} 是选自以下的基团:氢、烷基、卤代烷基、烯基、炔基、环烷基、环烷基烷基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基和氰基烷基。

2. 权利要求1的式(I)的化合物,其中

A是以下基团



(A-a)

其中虚线表示与式(I)的双环体系的氮原子连接的键,

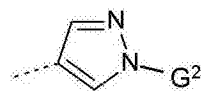
G^1 是C-B¹,

B¹是氢,

T是电子对,

R^1 是氢,

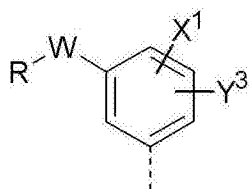
R^{2a} 是



(B-4)

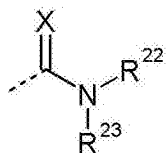
其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者

R^{2b} 是(D-2)基团



(D-2)

其中虚线表示与式 (I) 的双环体系的碳原子连接的键, 或者
R^{2c} 是下式的基团



其中虚线表示与式 (I) 的双环体系的碳原子连接的键, 或者
G² 是选自氢和 C₁-C₄-烷基的基团,

X 是氧,

X¹ 是选自以下的基团: 氢、氟、氯和溴,

R 是任选被一个、二个、三个、四个或五个氟或氯取代的 C₁-C₄-烷基,

W 是选自 S、S₀ 和 S₀₂ 的基团,

Y³ 是甲基或乙基,

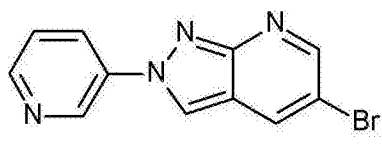
R²² 是选自以下的基团: C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基和 C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基, 且

R²³ 是氢或 C₁-C₆-烷基。

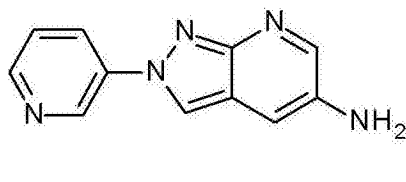
3. 组合物, 其特征在于含有至少一种权利要求 1 和 2 中任一项的式 (I) 的化合物, 和常规的增量剂和/或表面活性剂。

4. 权利要求 1 和 2 中任一项的式 (I) 的化合物或权利要求 3 的组合物用于防治害虫的用途。

5. 下式的化合物



6. 下式的化合物



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和其制备方法以及用于其制备的中间体。

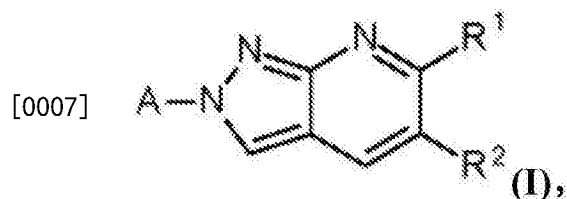
[0002] 最近,已经公开了具有杀虫特性的双环化合物(WO 2015/038503 A1)。

[0003] WO 2014/100695 A1记载了特别是含有N-取代的2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-1-基片段的PRMT5抑制剂的制备和药学用途。此外,WO 2010/056999记载了含有N-取代的2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-1-基片段的杀寄生物剂的制备。

[0004] 现代作物保护组合物必须满足许多要求,例如关于范围、持久性和其作用谱以及可能的用途。毒性和与其他活性成分或制剂助剂的结合性问题起到一定作用,合成活性成分所涉及的成本和复杂性问题亦是如此。此外,可能会产生抗性。仅是出于所有这些原因,也不能认为对新的作物保护组合物的研究已经完成,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特性的新的化合物。

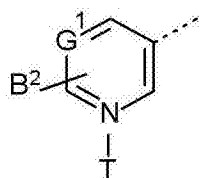
[0005] 本发明的目的是提供在多个方面拓宽农药谱的化合物。

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



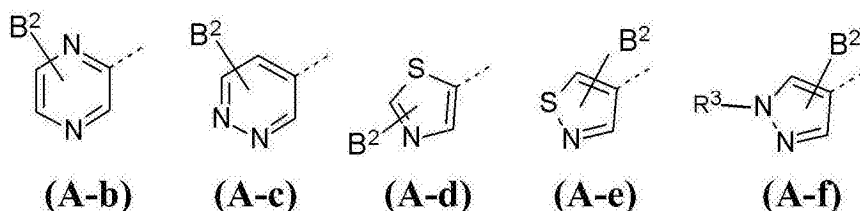
[0008] 其中

[0009] A是选自(A-a)至(A-f)的基团



(A-a)

[0010]



[0011] 其中虚线表示与式(I)的双环体系的氮原子连接的键,且

[0012] G¹是N或C-B¹,

[0013] B¹是选自氢、卤素、氰基、硝基、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基以及在每种情况下任选取代的环烷基和环烯基的基团,

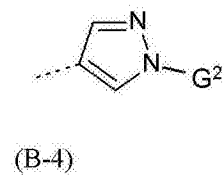
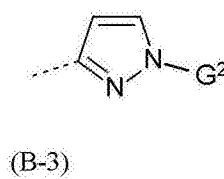
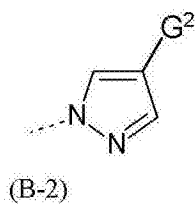
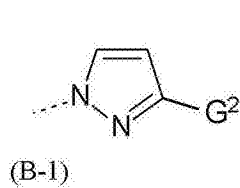
[0014] B²是选自氢、卤素、氰基、硝基、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基以及在每种情

况下任选取代的环烷基和环烯基的基团，

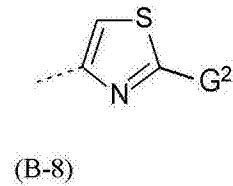
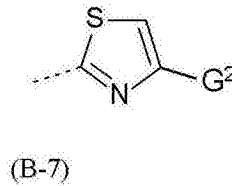
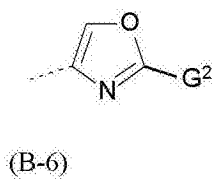
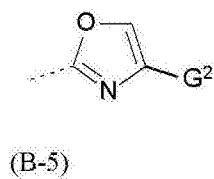
[0015] T是氧或电子对，

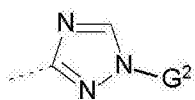
[0016] R^1 是选自氢、烷基、烷氧基和氰基的基团，

[0017] R^2a 是选自 (B-1) 至 (B-36) 的B基团

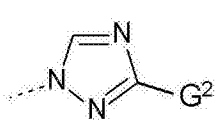


[0018]

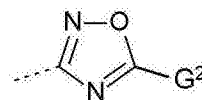




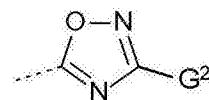
(B-9)



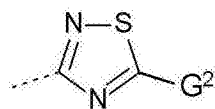
(B-10)



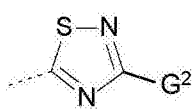
(B-11)



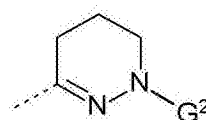
(B-12)



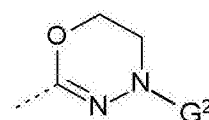
(B-13)



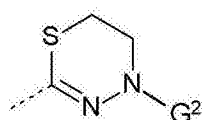
(B-14)



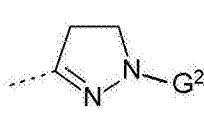
(B-15)



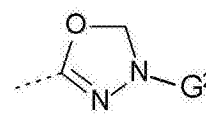
(B-16)



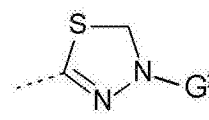
(B-17)



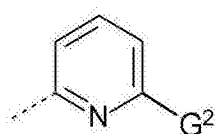
(B-18)



(B-19)

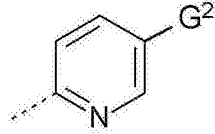


(B-20)

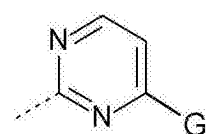


[0019]

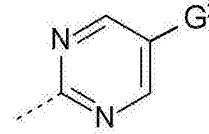
(B-21)



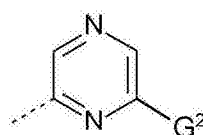
(B-22)



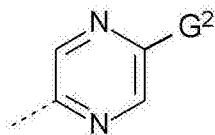
(B-23)



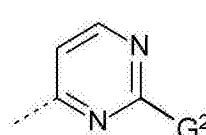
(B-24)



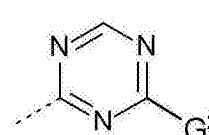
(B-25)



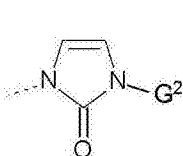
(B-26)



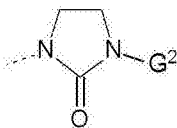
(B-27)



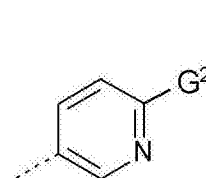
(B-28)



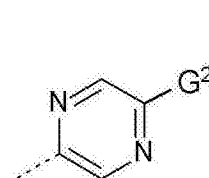
(B-29)



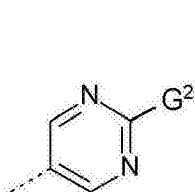
(B-30)



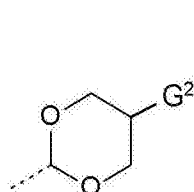
(B-31)



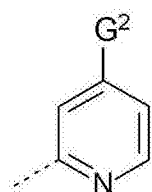
(B-32)



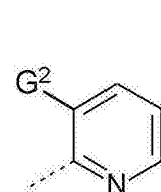
(B-33)



(B-34)



(B-35)

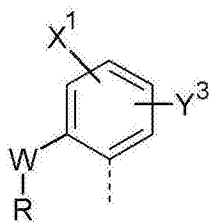


(B-36)

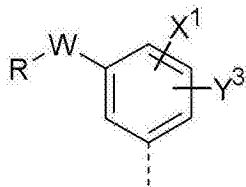
[0020] 其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者

[0021] R^{2b}是选自(D-1)至(D-3)的D基团

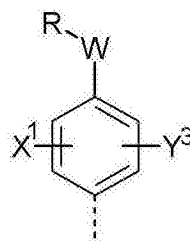
[0022]



(D-1)



(D-2)

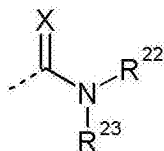


(D-3)

[0023] 其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者

[0024] R^{2c}是下式的基团

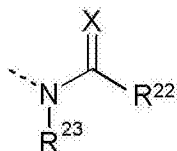
[0025]



[0026] 其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者

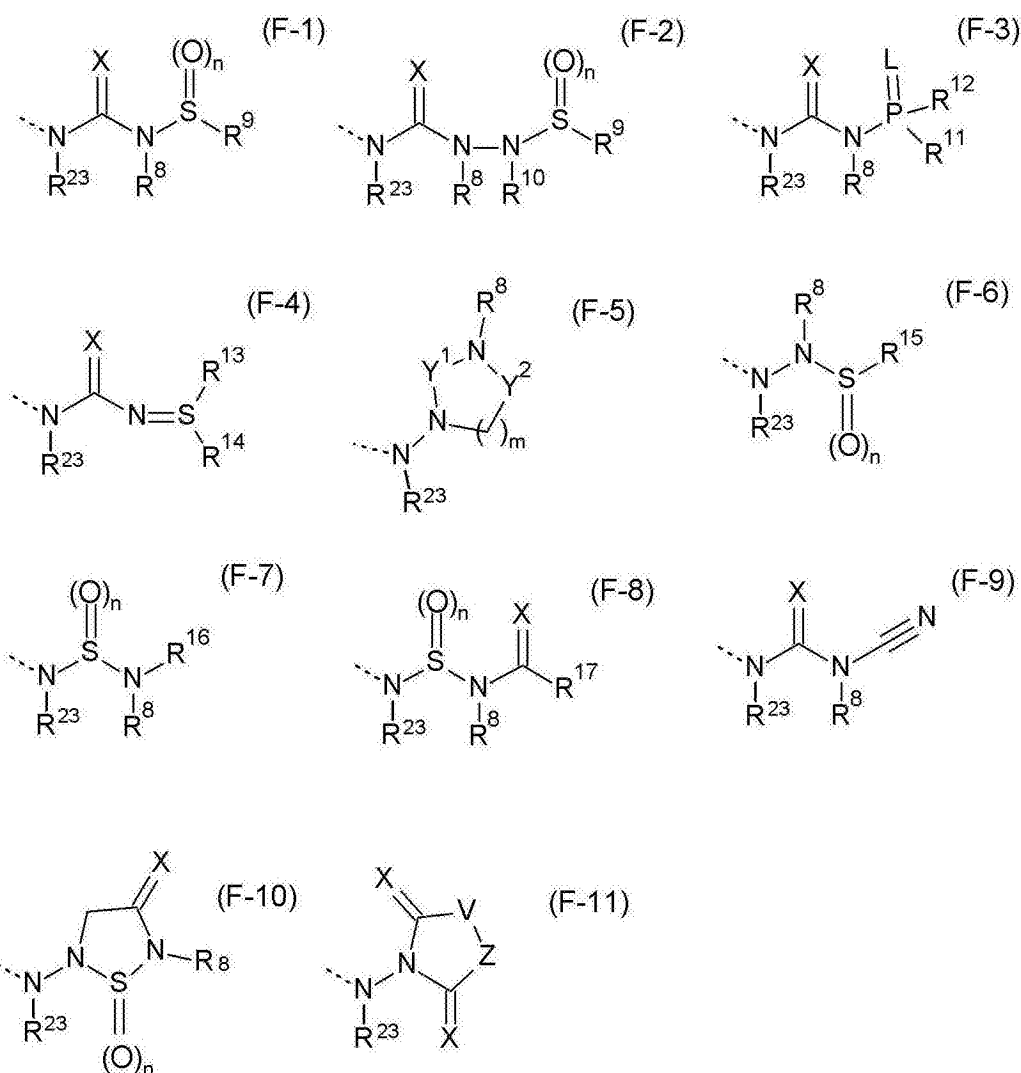
[0027] R^{2d}是下式的基团

[0028]



[0029] 其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者

[0030] R^{2e}是选自(F-1)至(F-11)的F基团



[0032] 其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者

[0033] R^{2f} 是选自卤代烷基、羧基和氨基的基团,

[0034] 其中

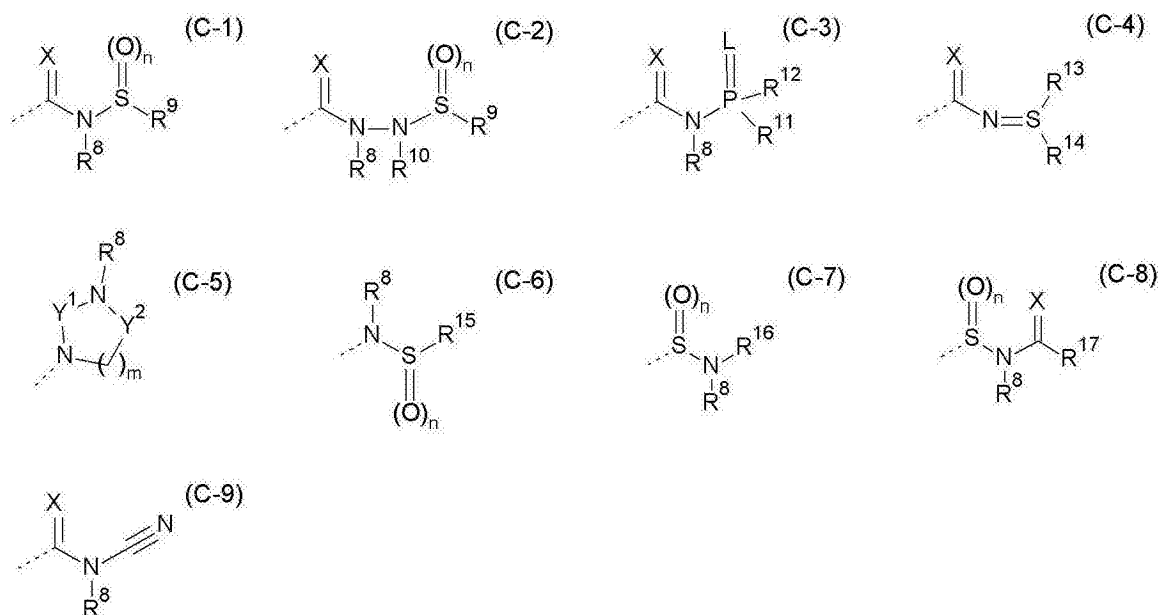
[0035] G^2 是氢或选自以下的基团: 卤素、硝基、氨基、氰基、烷基氨基、卤代烷基氨基、二烷基氨基、烷基、卤代烷基、烷氧基羰基烷基、任取代的且任选被一个或多个杂原子间隔的饱和或不饱和环烷基、环烷基烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷氧基烷基、卤代烷氧基烷基、烷硫基烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基、双(烷氧基)烷基、双(卤代烷氧基)烷基、烷氧基(烷硫基)烷基、烷氧基(烷基亚磺酰基)烷基、烷氧基(烷基磺酰基)烷基、双(烷硫基)烷基、双(卤代烷硫基)烷基、双(羟基烷硫基)烷基、烷氧基羰基、烷氧基羰基烷基、 α -羟基亚氨基烷氧基羰基烷基、 α -烷氧基亚氨基烷氧基羰基烷基、 $C(X^2)NR^3R^4$ 、 NR^6R^7 、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基, 杂环基团二氧杂环己烷基(dioxanyl)、二氧杂环戊烷基(dioxolanyl)、二氧杂环庚烷基(dioxepanyl)、二氧杂环辛烷基(dioxocanyl)、氧硫杂环己烷基(oxathianyl)、氧硫杂环戊烷基(oxathiolanyl)、氧硫杂环庚烷基(oxathiepanyl)、氧硫杂环辛烷基(oxathiocanyl)、二硫杂环己烷基(dithianyl)、二硫杂环戊烷基(dithiolanyl)、二硫杂环庚烷基(dithiepanyl)、二硫杂环辛烷基(dithiocanyl)、氧化氧硫杂环己烷基(oxathianyl oxide)、氧化氧硫杂环戊烷基(oxathiolanyl oxide)、氧化氧

硫杂环庚烷基 (oxathiepanyl oxide)、氧化氧硫杂环辛烷基 (oxathiocanyl oxide)、二氧化氧硫杂环己烷基 (oxathianyl dioxide)、二氧化氧硫杂环戊烷基 (oxathiolanyl dioxide)、二氧化氧硫杂环庚烷基 (oxathiepanyl dioxide)、二氧化氧硫杂环辛烷基 (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) (对于这些基团, 其可又被烷基、卤代烷基、烷氧基和烷氧基烷基取代), 苯基 (对于该基团, 其可又被卤素、氰基、硝基、烷基和卤代烷基取代), 杂芳基基团吡啶基、N-氧化吡啶基、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 (对于这些基团, 其可又被卤素、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 (对于这些基团, 其可又被卤素和烷基取代),

[0036] 或者

[0037] G^2 是选自 (C-1) 至 (C-9) 的基团

[0038]



[0039] 其中虚线表示与基团 (B-1) 至 (B-34) 连接的键,

[0040] X 是氧或硫,

[0041] X^1 是选自以下的基团: 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,

[0042] X^2 是氧、硫、 NR^5 或 NOH ,

[0043] L 是氧或硫,

[0044] V-Z 是 $R^{24}CH-CHR^{25}$ 或 $R^{24}C=CR^{25}$,

[0045] n 是 1 或 2,

[0046] m 是 1、2、3 或 4,

[0047] R 是 $NR^{18}R^{19}$, 或者是选自以下的在每种情况下任选取代的基团: 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，

[0048] R³是氢或烷基，

[0049] R⁴是选自以下的基团：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，

[0050] R⁵是选自以下的基团：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

[0051] R³和R⁴与它们所键合的氮原子一起形成环，该环可含有一个或多个选自氮、氧和硫的其他杂原子，或者

[0052] R³和R⁵与它们所键合的氮原子一起形成环，

[0053] R⁶是氢或烷基，

[0054] R⁷是选自以下的基团：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

[0055] R⁶和R⁷与它们所键合的氮原子一起形成环，该环可含有一个或多个选自氮、氧和硫的其他杂原子，

[0056] R⁸是选自以下的基团：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，在每种情况下任选卤素-取代的烷基羰基和烷基磺酰基，任选卤素-取代的烷氧基羰基，任选卤素-、烷基-、烷氧基-、卤代烷基-和氰基-取代的环烷基羰基，或者是阳离子或任选烷基-或芳基烷基-取代的铵离子，

[0057] R⁹是选自以下的基团：在每种情况下任选取代的烷基、烯基和炔基，在每种情况下任选取代的环烷基、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，在每种情况下任选取代的芳基、杂芳基、芳基烷基和杂芳基烷基，以及任选取代的氨基，

[0058] (C-1) 和 (F-1) 基团中的R⁸和R⁹与它们所键合的N-S(O)_n基团一起还可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] R¹⁰是氢或烷基，

[0060] (C-2) 和 (F-2) 基团中的R⁸和R¹⁰与它们所键合的氮原子一起还可以是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，

[0061] (C-2) 和 (F-2) 基团中的R⁹和R¹⁰与它们所键合的N-S(O)_n基团一起还可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，

[0062] R¹¹是选自以下的在每种情况下任选取代的基团：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,

[0063] R^{12} 是选自以下的在每种情况下任选取代的基团: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,

[0064] (C-3) 和 (F-3) 基团中的 R^{11} 和 R^{12} 与它们所键合的磷原子一起还可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,

[0065] R^{13} 是选自以下的在每种情况下任选取代的基团:烷基、烯基、炔基、苯基和苯基烷基,

[0066] R^{14} 是选自以下的在每种情况下任选取代的基团:烷基、烯基、炔基、苯基和苯基烷基,

[0067] R^{15} 是选自以下的基团:在每种情况下任选取代的烷基、烯基和炔基,在每种情况下任选取代的环烷基、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,在每种情况下任选取代的芳基、杂芳基、芳基烷基和杂芳基烷基,以及任选取代的氨基,

[0068] (C-6) 和 (F-6) 基团中的 R^8 和 R^{15} 与它们所键合的N-S(O)_n基团一起还可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,

[0069] R^{16} 是选自以下的基团:氢,在每种情况下任选取代的烷基、烷氧基、烯基和炔基,在每种情况下任选取代的环烷基、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,在每种情况下任选取代的芳基、杂芳基、芳基烷基和杂芳基烷基,以及任选取代的氨基,

[0070] (C-7) 和 (F-7) 基团中的 R^8 和 R^{16} 与它们所键合的氮原子一起还可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,

[0071] R^{17} 是选自以下的基团:在每种情况下任选取代的烷基、烷氧基、烯基和炔基,在每种情况下任选取代的环烷基、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,在每种情况下任选取代的芳基、杂芳基、芳基烷基和杂芳基烷基,以及任选取代的氨基,

[0072] (C-8) 和 (F-8) 基团中的 R^8 和 R^{17} 与它们所键合的N-C(X)基团一起还可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,

[0073] R^{18} 是选自以下的基团:氢,羟基,在每种情况下任选取代的烷基、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,在每种情况下任选取代的环烷基、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,在每种情况下任选取代的芳基、芳基烷基、杂芳基和杂芳基烷基,以及任选取代的氨基,

[0074] R^{19} 是选自氢的基团,是碱金属或碱土金属离子,或是任选被C₁-C₄-烷基单-至四取代的铵离子,或是在每种情况下任选卤素-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、烷基磺酰基烷基基团，

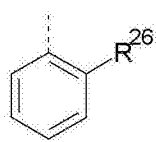
[0075] Y^1 和 Y^2 独立地是C=O或S(O)₂，

[0076] Y^3 是选自以下的基团：氢、卤素、氰基、烷基、环烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基和NR²⁰R²¹，

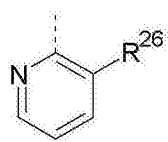
[0077] W是选自以下的基团：O、S、SO和SO₂，

[0078] R^{22} 是选自以下的基团：烷基，任选卤素-、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，或者在 $R^2=d$ 的情况下，

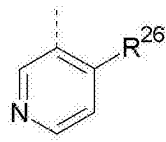
[0079] R^{22} 还是任选取代的芳基或选自E-1至E-51的基团



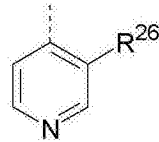
E-1



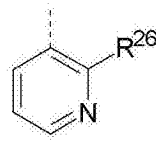
E-2



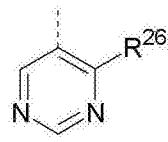
E-3



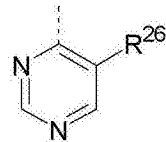
E-4



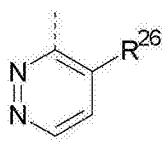
E-5



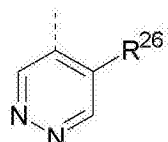
E-6



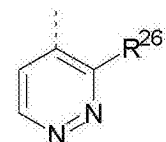
E-7



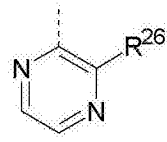
E-8



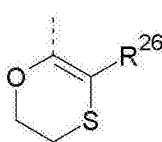
E-9



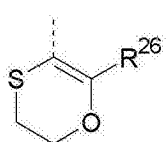
E-10



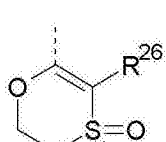
E-11



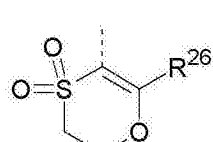
E-12



E-13

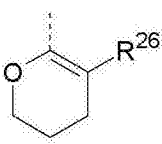


E-14

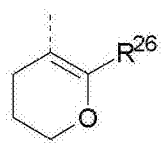


E-15

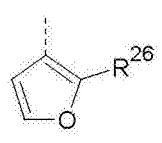
[0080]



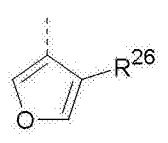
E-16



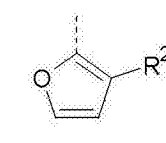
E-17



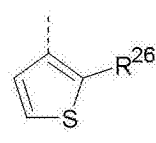
E-18



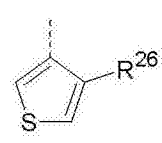
E-19



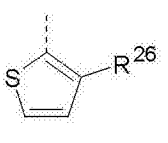
E-20



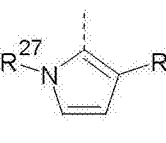
E-21



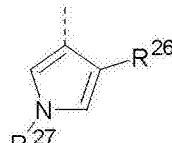
E-22



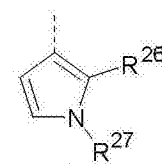
E-23



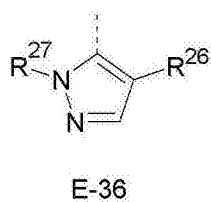
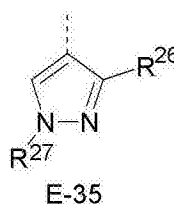
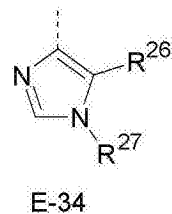
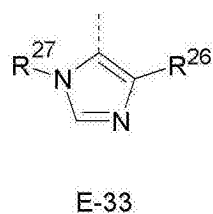
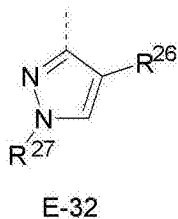
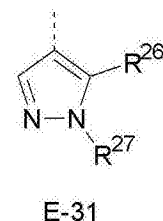
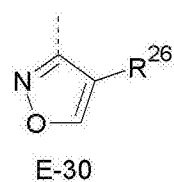
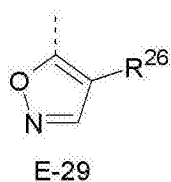
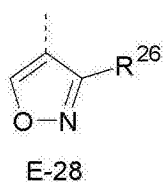
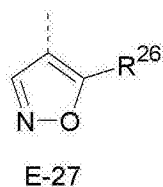
E-24



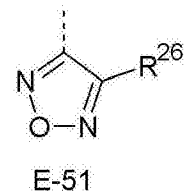
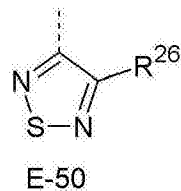
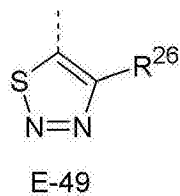
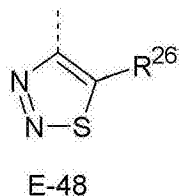
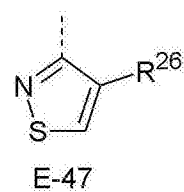
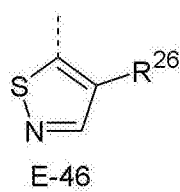
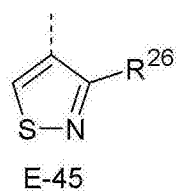
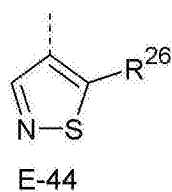
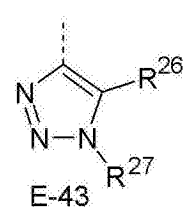
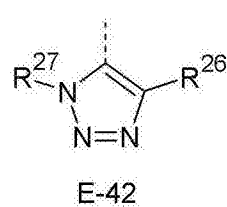
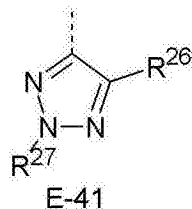
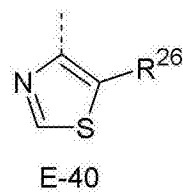
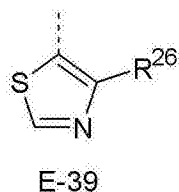
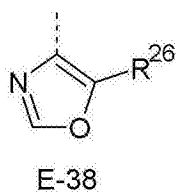
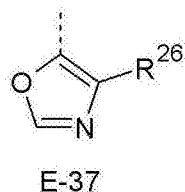
E-25



E-26



[0081]



[0082] R^{20} 是选自以下的基团:氢、卤素、氰基、硝基、氨基、羟基,和在每种情况下任选取代的烷基、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、烷基羰氧基、烯基羰氧基、炔基羰氧基、环烷基羰氧基、烷氧基羰氧基、烷基磺酰氧基、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,

[0083] R^{21} 是选自以下的基团: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,

[0084] R^{23} 是选自以下的基团: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

[0085] R^{24} 是氢或选自以下的在每种情况下任选取代的基团:烷基、烯基、炔基、苯基和苯基烷基,且

[0086] R^{25} 是氢或选自以下的在每种情况下任选取代的基团:烷基、烯基、炔基、苯基和苯基烷基,

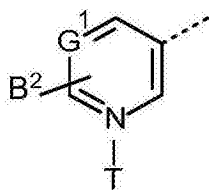
[0087] R^{27} 是氢或烷基,且

[0088] R^{26} 是选自以下的基团:氢、烷基、卤代烷基、烯基、炔基、环烷基、环烷基烷基、烷氧基烷基、烷硫基烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基和氰基烷基。

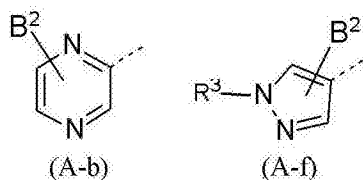
[0089] 另外,已发现式(I)的化合物以及表1中所列的化合物(未包括在式(I)中)作为农药具有良好的功效,例如对抗节肢动物且尤其是昆虫,并且此外通常与植物、尤其是作物植物具有非常好的相容性,和/或具有有利的毒理学和/或有利的的环境相关特性。

[0090] 优选范围(1):优选这样的式(I)的化合物,其中

[0091] A是选自以下的基团:(A-a)、(A-b)和(A-f)



[0092] (A-a)



[0093] 其中虚线表示与双环体系的氮原子连接的键,且

[0094] G^1 是N或C- B^1 ,

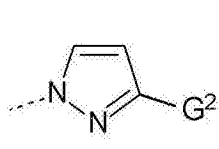
[0095] B^1 是选自以下的基团:氢、卤素、 C_1 - C_6 -烷基和 C_1 - C_4 -卤代烷基,

[0096] B^2 是选自以下的基团:氢、卤素、 C_1 - C_6 -烷基和 C_1 - C_4 -卤代烷基,

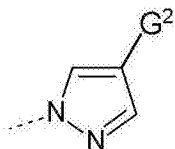
[0097] T是氧或电子对,

[0098] R^1 是选自以下的基团:氢、 C_1 - C_6 -烷基和 C_1 - C_6 -烷氧基,

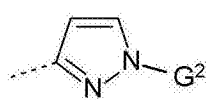
[0099] R^2a 是选自 (B-1) 至 (B-36) 的基团



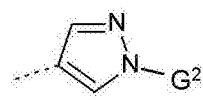
(B-1)



(B-2)

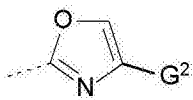


(B-3)

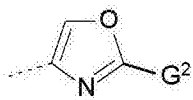


(B-4)

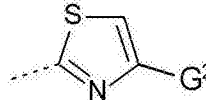
[0100]



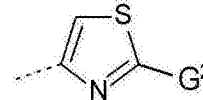
(B-5)



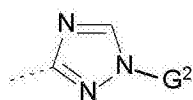
(B-6)



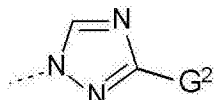
(B-7)



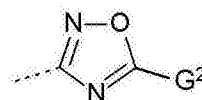
(B-8)



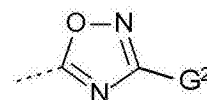
(B-9)



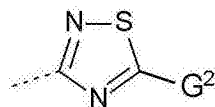
(B-10)



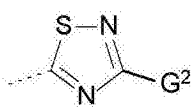
(B-11)



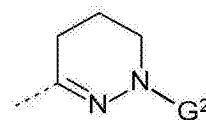
(B-12)



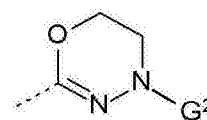
(B-13)



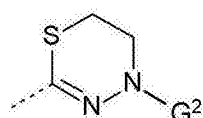
(B-14)



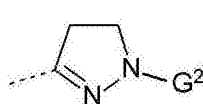
(B-15)



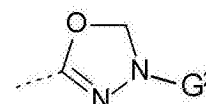
(B-16)



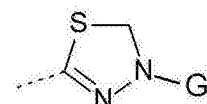
(B-17)



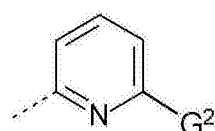
(B-18)



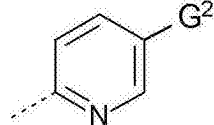
(B-19)



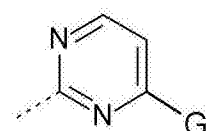
(B-20)



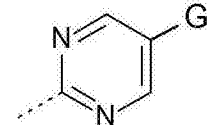
(B-21)



(B-22)

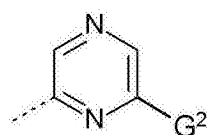


(B-23)

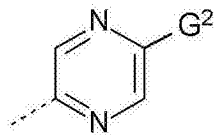


(B-24)

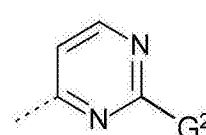
[0101]



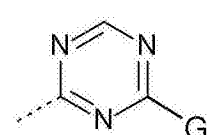
(B-25)



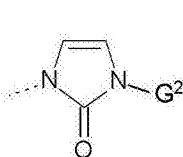
(B-26)



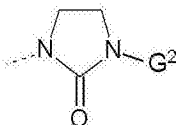
(B-27)



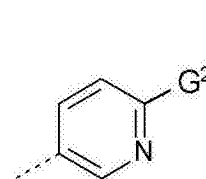
(B-28)



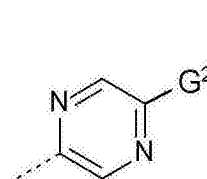
(B-29)



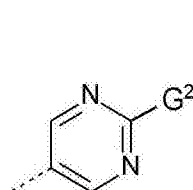
(B-30)



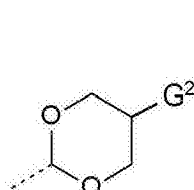
(B-31)



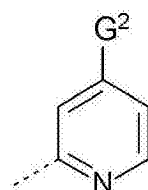
(B-32)



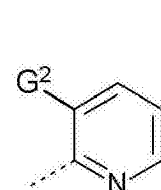
(B-33)



(B-34)



(B-35)

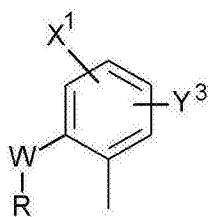


(B-36)

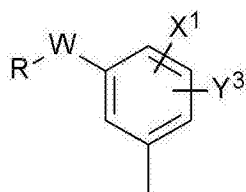
[0102] 其中虚线表示与双环体系的碳原子连接的键,或者

[0103] R²b) 是选自 (D-1) 至 (D-3) 的基团

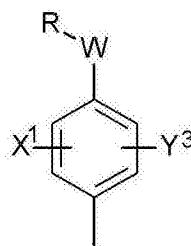
[0104]



(D-1)

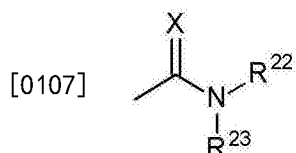


(D-2)



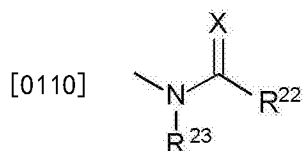
(D-3)

[0105] 或者

[0106] R^{2c}) 是下式的基团

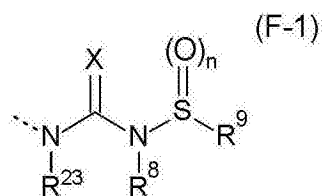
[0107]

[0108] 或者

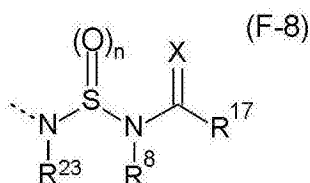
[0109] R^{2d}) 是下式的基团

[0110]

[0111] 或者

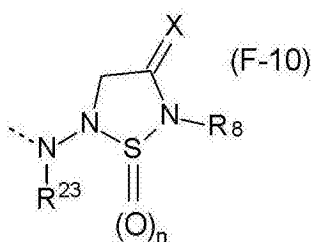
[0112] R^{2e}) 是选自 (F-1)、(F-8)、(F-10) 和 (F-11) 的基团

(F-1)

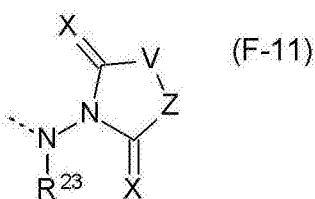


(F-8)

[0113]



(F-10)



(F-11)

[0114] 其中虚线表示与式 (I) 中的碳原子连接的键, 或者 R^{2f}) 是选自 C₁-C₆-卤代烷基、羧基和氨基的基团,

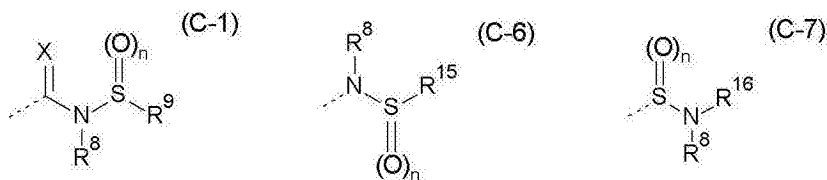
[0115] 其中

[0116] G² 是氢或选自以下的基团: 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、C₁-C₄-烷基、卤代-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烯基、C₃-C₆-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、卤代C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、双 (C₁-C₄-烷氧基)-C₁-C₄-烷基、双 (卤代-C₁-C₄-烷氧基)-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基 (C₁-C₄-烷硫基)-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基

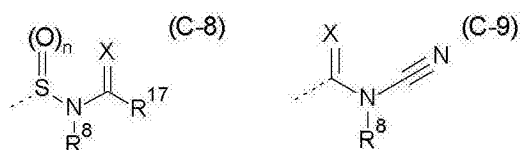
基(C₁-C₄-烷基亚磺酰基)-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基(C₁-C₄-烷基磺酰基)-C₁-C₄-烷基、双(C₁-C₄-烷硫基)-C₁-C₄-烷基、双(卤代-C₁-C₄-烷硫基)-C₁-C₄-烷基、双(羟基-C₁-C₄-烷硫基)-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基羰基、C₁-C₄-烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基、α-羟基亚氨基-C₁-C₄-烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基、α-C₁-C₄-烷氧基-亚氨基-C₁-C₄-烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基、C(X²)NR³R⁴、NR⁶R⁷、C₁-C₄-烷硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、杂环基基团二氧杂环己烷基、二氧杂环戊烷基、二氧杂环庚烷基、二氧杂环辛烷基、氧硫杂环己烷基、氧硫杂环戊烷基、氧硫杂环庚烷基、氧硫杂环辛烷基、二硫杂环己烷基、二硫杂环戊烷基、二硫杂环庚烷基、二硫杂环辛烷基、氧化氧硫杂环己烷基、氧化氧硫杂环戊烷基、氧化氧硫杂环庚烷基、氧化氧硫杂环辛烷基、二氧化氧硫杂环己烷基、二氧化氧硫杂环戊烷基、二氧化氧硫杂环庚烷基、二氧化氧硫杂环辛烷基、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(对于这些基团,其可又被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(对于该基团,其可又被卤素、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、N-氧化吡啶基、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(对于这些基团,其可又被卤素、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(对于这些基团,其可又被卤素和C₁-C₄-烷基取代),

[0117] 或者

[0118] G²是选自(C-1)和(C-6)至(C-9)的基团



[0119]



[0120] 其中虚线表示与基团(B-1)至(B-34)连接的键,

[0121] X是氧或硫,

[0122] X¹是选自以下的基团: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,

[0123] X²是氧、硫、NR⁵或NOH,

[0124] V-Z是R²⁴CH-CHR²⁵或R²⁴C=CR²⁵,

[0125] n是1或2,

[0126] R是NR¹⁸R¹⁹,或在每种情况下任选卤素-、氧-(得到C=O)或氰基-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(0)-C₁-C₄-烷基、C₁-C₆-烷基-S(0)₂-C₁-C₄-烷基, R¹⁸-CO-C₁-C₄-烷基, NR¹⁸R¹⁹-CO-C₁-C₄-烷基, 任选单-或二-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, 任选单-或二-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-取代的C₃-C₈-环烯基, 任选单-或二-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-取代的C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基, 任选单-或二-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-取代的C₃-C₆-环烯基-C₁-C₄-烷基, 任选单-或二-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-取代的杂环基, 任选单-或二-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-取代的杂环基-C₁-C₄-烷基, 或在每种情况下任选单-至三-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-取代的苯基、苯基-C₁-C₄-烷基、杂芳基和杂芳基-C₁-C₄-烷基,

[0127] R³是氢或C₁-C₆-烷基,

[0128] R⁴是选自以下的基团: 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,

[0129] R⁵是选自以下的基团: 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

[0130] R³和R⁴与它们所键合的氮原子一起形成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,

[0131] R⁶是氢或C₁-C₄-烷基,

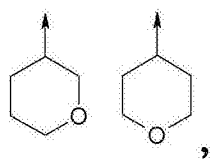
[0132] R⁷是选自以下的基团: 氢、C₁-C₄-烷基、卤代-C₁-C₄-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₄-环烷基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、卤代-C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基羰基、C₁-C₄-烷氧基羰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基、芳基、芳基-C₁-C₄-烷基和杂芳基-C₁-C₄-烷基, 或者

[0133] R⁶和R⁷与它们所键合的氮原子一起形成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,

[0134] R⁸是选自以下的基团: 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, 在每种情况下任选卤素-取代的C₁-C₆-烷基羰基和C₁-C₆-烷基磺酰基, 任选卤素-取代的C₁-C₆-烷氧基羰基, 任选卤素-、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, 或者是阳离子或任选C₁-C₆-烷基-或芳基-C₁-C₆-烷基-取代的铵离子,

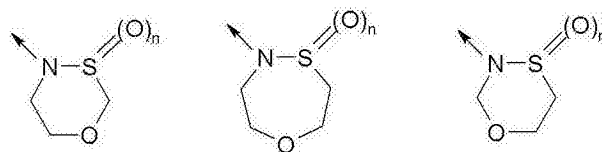
[0135] R⁹是选自以下的基团: 在每种情况下任选卤素-、C₁-C₆-烷氧基-、C₁-C₆-卤代烷氧基-、C₁-C₆-烷硫基-、C₁-C₆-卤代烷硫基-、C₁-C₆-烷基亚磺酰基-、C₁-C₆-卤代烷基亚磺酰基-、C₁-C₆-烷基磺酰基-和C₁-C₆-卤代烷基磺酰基-取代的C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基和C₂-C₆-炔基, 在每种情况下任选卤素-、C₁-C₆-烷基-、C₁-C₆-卤代烷基-、C₁-C₆-烷氧基-或C₁-C₆-卤代烷氧基-

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(并且此处尤其是

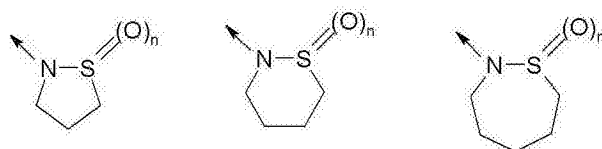


[0136] 其中箭头在每种情况下表示与(C-1)基团和(F-1)基团中的硫原子键合),在每种情况下任选卤素-、氰基-(包括在烷基部分中的)、硝基-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -卤代烷基-、 C_3-C_6 -环烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_6 -卤代烷氧基-、 C_1-C_6 -烷基磺基-、 C_1-C_6 -卤代烷基磺基-、 C_1-C_6 -烷基亚磺酰基-、 C_1-C_6 -卤代烷基亚磺酰基-、 C_1-C_6 -烷基磺酰基-、 C_1-C_6 -卤代烷基磺酰基-、氨基-、 C_1-C_6 -烷基氨基-、二(C_1-C_6 -烷基)氨基-、 C_1-C_6 -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-,或者是 $NR'R''$,其中 R' 和 R'' 独立地是选自以下的基团: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,或者

[0137] (C-1)基团和(F-1)基团中的 R^8 和 R^9 与它们所键合的 $N-S(O)_n$ 基团一起还可形成饱和或不饱和的且任选卤素-、 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/或至少一个且优选一个羰基;特别地, R^8 和 R^9 与它们所键合的 $N-S$



($O)_n$ 基团一起可以是选自以下的基团



[0138] (其中箭头在每种情况下表示与C(X)基团键合),

[0139] R^{15} 是选自以下的基团:在每种情况下任选甲基-、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,在每种情况下任选甲基-、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,在每种情况下任选 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -卤代烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基-、 C_1-C_4 -卤代烷氧基-、 C_1-C_4 -烷基磺基-、 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 C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -烷基羰基-、 C_1-C_4 -烷基- C_1-C_4 -烷氧基羰基-或 C_1-C_4 -烷基磺酰基-取代的氨基,

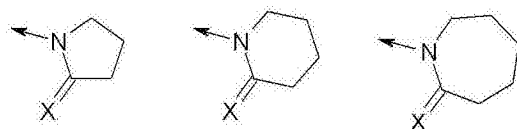
[0140] (C-6)基团中 R^8 和 R^{15} 与它们所键合的 $N-S(O)_n$ 基团一起还可形成饱和或不饱和的且任选取代的4至8元环,所述4至8元环可含有一个或两个选自硫、氧(其中氧原子和硫原子

不能彼此直接相邻)和氮的其他杂原子和/或至少一个羰基,

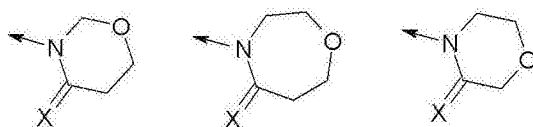
[0141] R^{16} 是选自以下的基团:氢,在每种情况下任选甲基-、氰基-、氨基甲酰基-或羧基-取代的 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_2-C_4 -烯基和 C_2-C_4 -炔基,在每种情况下任选卤素-、氰基-、硝基-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -卤代烷基-、 C_3-C_6 -环烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_6 -卤代烷氧基-、 C_1-C_6 -烷硫基-、 C_1-C_6 -卤代烷硫基-、 C_1-C_6 -烷基亚磺酰基-、 C_1-C_6 -卤代烷基亚磺酰基-、 C_1-C_6 -烷基磺酰基-、 C_1-C_6 -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_2-C_6 -烯基-、 C_2-C_6 -炔基-或 C_1-C_6 -烷基羰基-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_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,在每种情况下任选卤素-、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-、 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_2-C_6 -烯基-、 C_2-C_6 -炔基-或 C_1-C_6 -烷基羰基-取代的芳基、杂芳基、芳基- C_1-C_2 -烷基和杂芳基- C_1-C_2 -烷基,以及任选 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-、 C_2-C_6 -烯基-、 C_2-C_6 -炔基-或 C_1-C_6 -烷基羰基-取代的氨基,

[0142] R^{17} 是选自以下的基团:在每种情况下任选卤素-、 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-或 C_1-C_6 -卤代烷基磺酰基-取代的 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_2-C_6 -烯基和 C_2-C_6 -炔基,在每种情况下任选卤素-、 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,N-吡咯烷基、N-哌啶基、N-吗啉基、N-硫代吗啉基、1-氧化N-硫代吗啉基、1,1-二氧化N-硫代吗啉基、N-哌嗪基、N-1-甲基哌嗪基或N-2-氧-1-甲基哌嗪基,在每种情况下任选卤素-、氰基-(包括在烷基部分中的)、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,或者是 $NR'R''$,其中 R' 和 R'' 各自独立地是选自以下的基团: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,

[0143] (C-8)基团和(F-8)基团中的 R^8 和 R^{17} 与它们所键合的N-C(X)基团一起还可形成饱和或不饱和的且任选卤素-、 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)和氮的其他杂原子和/或一个羰基;特别地, R^8 和 R^{17} 与它们所键合的N-C(X)基团一起可以是选自以下的基团



[0144]



[0145] (其中箭头在每种情况下表示与(C-8)基团和(F-8)基团中的硫原子键合),

[0146] R^{18} 是选自以下的基团:氢,羟基,在每种情况下任选单-或多-卤素-取代的或者单-或二-氰基-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,以及在每种情况下任选单-至四- 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-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,

[0147] R^{19} 是氢、碱金属或碱土金属离子或任选单-至四- C_1 - C_4 -烷基-取代的铵离子,或者是选自以下的在每种情况下任选单-或多-卤素-取代或者单-或二-氰基-取代的基团: C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_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,

[0148] Y^3 是选自以下的基团:氢、卤素、氰基、 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 -卤代烷氧基和 $NR^{20}R^{21}$,

[0149] W是选自以下的基团:O、S、SO和SO₂,

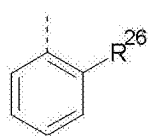
[0150] R^{22} 是选自以下的基团: C_1 - C_6 -烷基,任选卤素-、氨基甲酰基-、硫代氨基甲酰基-或氰基-取代的 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷基、 C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 C_1 - C_6 -烷氧基- C_1 - C_6 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷硫基、 C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 -烷基磺酰基、 C_1 - C_4 -卤代烷硫基、 C_1 - C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1 - C_4 -卤代烷基磺酰基、 C_1 - C_4 -烷硫基- C_1 - C_4 -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、 C_1 - C_4 -烷硫基- 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 -卤代烷硫基- 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 -烷硫基- 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 -烯硫基- 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,

[0151] 在 $R^2=d$ 的情况下,

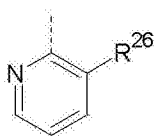
[0152] R^{22} 还是任选卤素-、氰基-、硝基-、氨基-、羟基-、 C_1 - C_6 -烷基-、 C_1 - C_6 -卤代烷基-、 C_2 - C_6 -烯基-、 C_2 - C_6 -炔基-、 C_3 - C_6 -环烷基-、 C_3 - C_6 -烯氧基-、 C_3 - C_6 -炔氧基-、 C_1 - C_6 -烷氧基-、 C_1 - C_4 -卤代烷氧基-、 C_1 - C_6 -烷氧基羰氧基-、 C_1 - C_6 -烷基氨基-、 C_3 - C_6 -烯基氨基-、 C_3 - C_6 -炔基氨基-、 C_3 - C_6 -环烷基氨基-、 C_1 - C_6 -烷硫基-、 C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基-、 C_1 - C_4 -烷基磺酰基-、 C_3 -

C₆-烯硫基-、C₃-C₆-炔硫基-、C₃-C₆-环烷硫基-、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C₁-C₆-二烷基氨基-取代的芳基,或者是选自E-1至E-51的基团

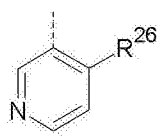
[0153]



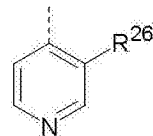
E-1



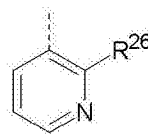
E-2



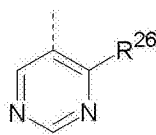
E-3



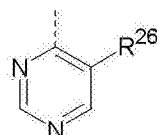
E-4



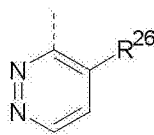
E-5



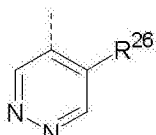
E-6



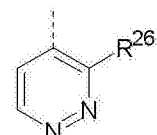
E-7



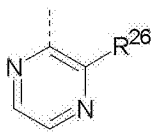
E-8



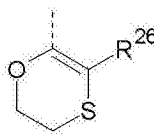
E-9



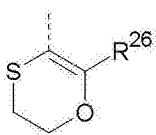
E-10



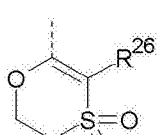
E-11



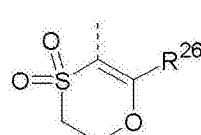
E-12



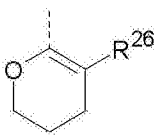
E-13



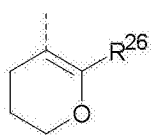
E-14



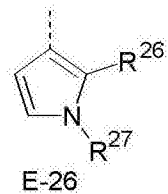
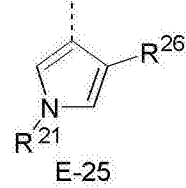
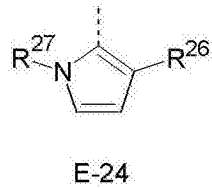
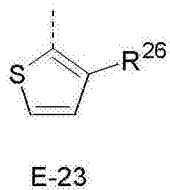
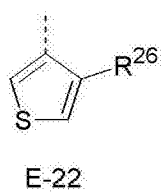
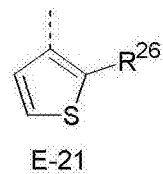
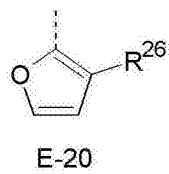
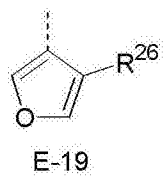
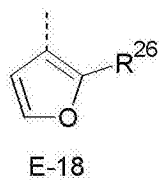
E-15



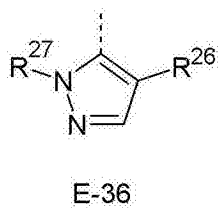
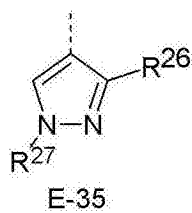
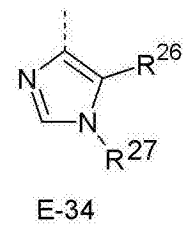
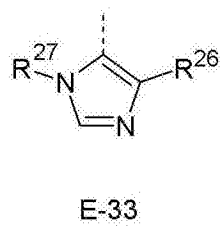
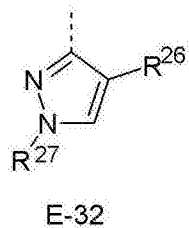
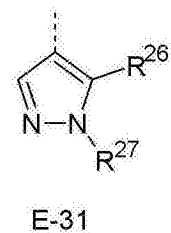
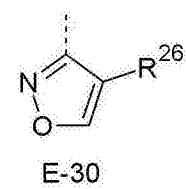
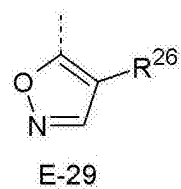
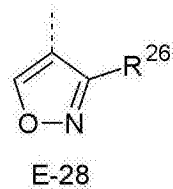
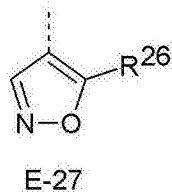
E-16

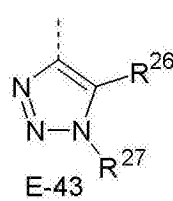
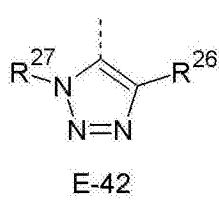
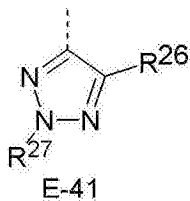
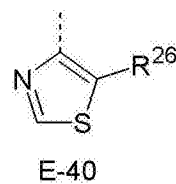
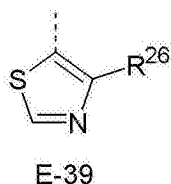
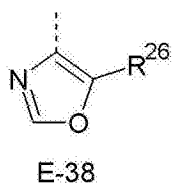
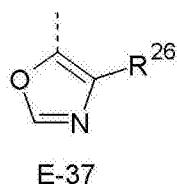


E-17

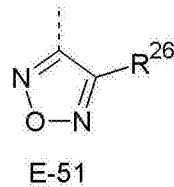
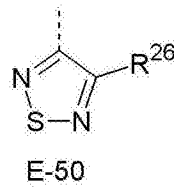
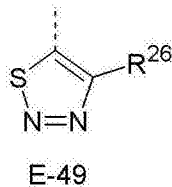
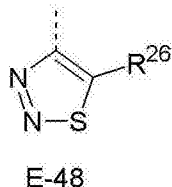
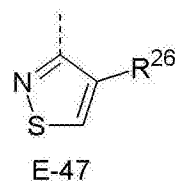
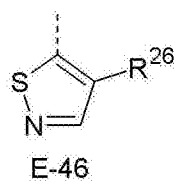
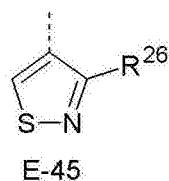
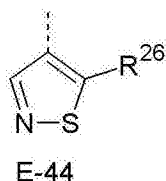


[0154]





[0155]



[0156] R^{20} 是选自以下的基团: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 -烷基羰氧基、 C_2 - C_6 -烯基羰氧基、 C_2 - C_6 -炔基羰氧基、 C_3 - C_6 -环烷基羰氧基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰氧基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰氧基、 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,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,

[0157] R^{21} 是选自以下的基团: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,

[0158] R^{23} 是选自以下的基团: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,

[0159] R^{24} 是氢或选自以下的在每种情况下任选卤素-或氰基-取代的基团: 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,

[0160] R^{25} 是氢或选自以下的在每种情况下任选卤素-或氰基-取代的基团: C_1 - C_4 -烷基、

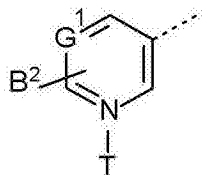
C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、苯基和苯基-C₁-C₂-烷基，

[0161] R²⁷是氢或C₁-C₄-烷基，且

[0162] R²⁶是选自以下的基团：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。

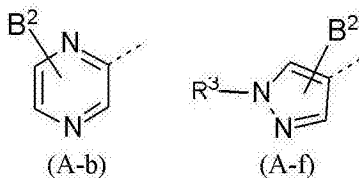
[0163] 优选范围(2)：特别优选这样的式(I)的化合物，其中

[0164] A是选自(A-a)、(A-b)和(A-f)的基团



(A-a)

[0165]



(A-b)

(A-f)

[0166] 其中虚线表示与式(I)的双环体系的氮原子连接的键，

[0167] G¹是N或C-B¹，

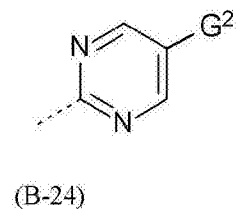
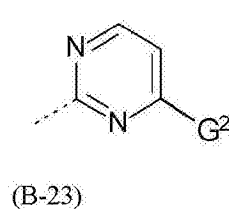
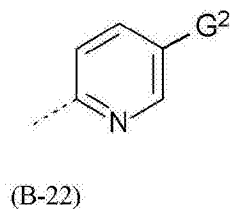
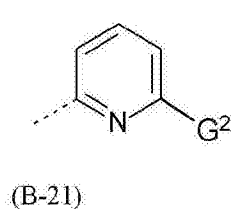
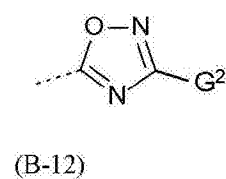
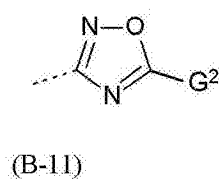
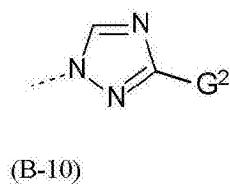
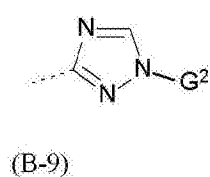
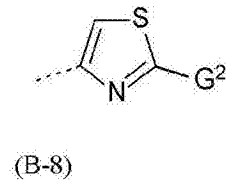
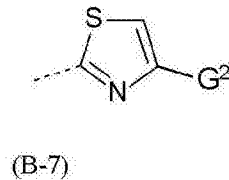
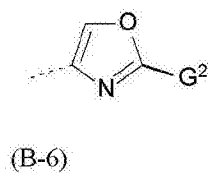
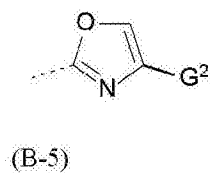
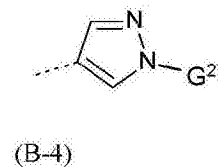
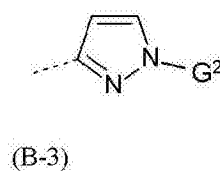
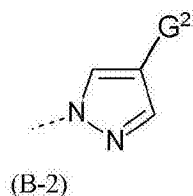
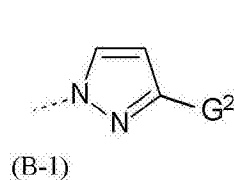
[0168] B¹是选自以下的基团：氢、卤素、C₁-C₆-烷基和C₁-C₄-卤代烷基，

[0169] B²是选自以下的基团：氢、卤素、C₁-C₆-烷基和C₁-C₄-卤代烷基，

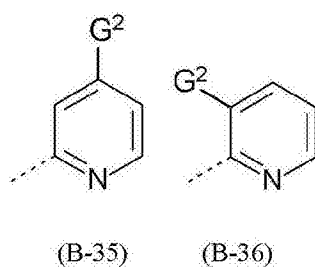
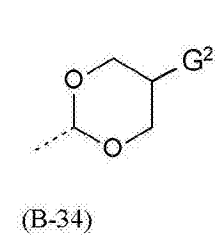
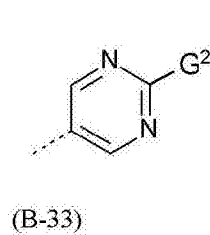
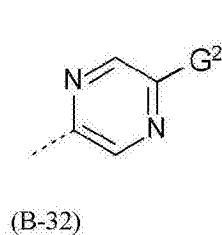
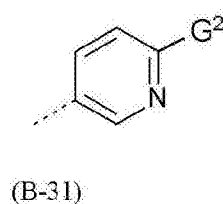
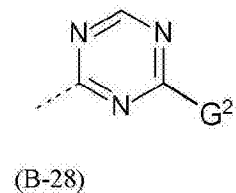
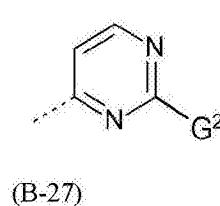
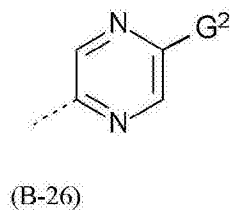
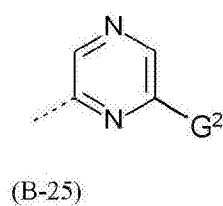
[0170] T是氧或电子对，

[0171] R¹是选自以下的基团：氢、C₁-C₄-烷基和C₁-C₄-烷氧基，

[0172] R^{2a}是选自以下的B基团



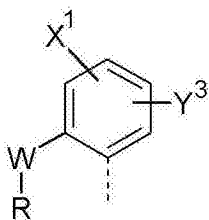
[0173]



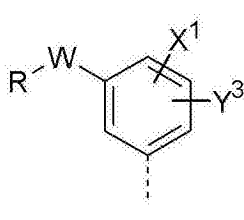
[0174] 其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者

[0175] R²b) 是选自 (D-1) 至 (D-3) 的D基团

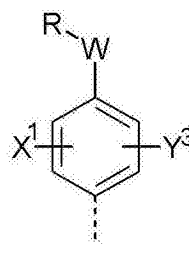
[0176]



(D-1)



(D-2)

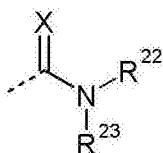


(D-3)

[0177] 其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者

[0178] R^{2c}是下式的基团

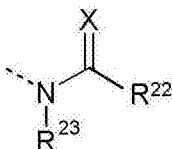
[0179]



[0180] 其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者

[0181] R^{2d}是下式的基团

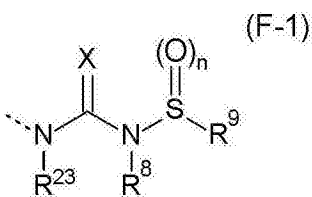
[0182]



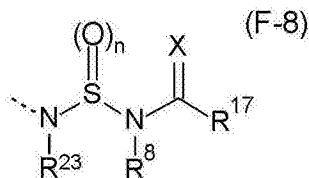
[0183] 其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者

[0184] R^{2e}是选自(F-1)、(F-8)和(F-10)的F基团

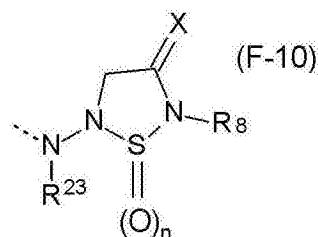
[0185]



(F-1)



(F-8)



(F-10)

[0186] 其中虚线表示与式(I)中的碳原子连接的键,或者

[0187] R^{2f}是选自C₁-C₆-卤代烷基、羧基和氨基的基团,

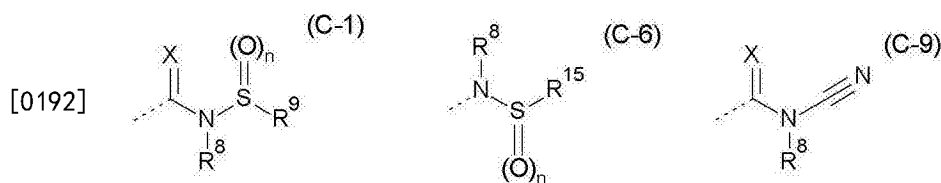
[0188] 其中

[0189] G²是氢或选自以下的基团: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、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基羰基-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、卤代C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、双(C₁-C₄-烷氧基)-C₁-C₄-烷基、双(卤代-C₁-C₄-烷氧基)-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-(C₁-C₄-烷硫基)-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、双(C₁-C₄-烷硫基)-C₁-C₄-烷基、双(卤代-C₁-C₄-烷硫基)-C₁-C₄-烷基、双(羟基-C₁-C₄-烷硫基)-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,杂环基团二氧杂环己烷基、二氧杂环戊烷基、二氧杂环庚烷基、二氧杂环辛烷基、氧硫杂环己烷基、氧硫杂环戊烷基、氧硫杂环庚烷基、氧硫杂环辛烷基、二硫杂环己烷基、二硫杂环戊烷基、二硫杂环庚烷基、二硫杂环辛烷基、氧化氧硫杂环己烷基、氧化氧硫杂环戊烷基、氧化氧

硫杂环庚烷基、氧化氧硫杂环辛烷基、二氧化氧硫杂环己烷基、二氧化氧硫杂环戊烷基、二
氧化氧硫杂环庚烷基、二氧化氧硫杂环辛烷基、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(对于这些基团,其可又被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(对于该基团,
其可又被卤素、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、N-氧
化吡啶基、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、四嗪基和异噻啉基(对于这些基团,其可又被卤素、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(对于这些基团,其可又被卤素和C₁-C₄-烷基取代),

[0190] 或者

[0191] G²是选自(C-1)、(C-6)和(C-9)的C基团



[0193] 其中虚线表示与B基团连接的键,

[0194] X是氧,

[0195] X¹是选自以下的基团:氢、氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、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,

[0196] X²是氧、硫、NR⁵或NOH,

[0197] n是2,

[0198] R是NR¹⁸R¹⁹,或者是在每种情况下任选单-至七-卤素-取代的、单-或二-氧-取代的
(得到C=O)或单-或二-氰基-取代的C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-烯基、C₃-C₆-炔基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-
C₃-烷基、C₁-C₄-烷基-S-C₁-C₃-烷基、C₁-C₄-烷基-S(O)-C₁-C₃-烷基、C₁-C₄-烷基-S(O)₂-C₁-C₃-
烷基、R¹⁸-CO-C₁-C₂-烷基、NR¹⁸R¹⁹-CO-C₁-C₂-烷基,任选单-或二-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-取代的C₃-C₆-环烷基,任选单-或
二-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-取
代的C₃-C₈-环烯基,任选单-或二-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-取代的C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基,任选单-或二-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-取代的C₃-C₆-环烯
基-C₁-C₄-烷基,任选单-或二-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-取代的杂环基,任选单-或二-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-取代的杂环基-C₁-C₄-烷基,或在每种情况
下任选单-至三-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-取代的苯基、苯基-C₁-C₄-烷基、杂芳基和杂芳基-C₁-C₄-烷
基,

[0199] R³是C₁-C₄-烷基,

[0200] R^4 是选自以下的基团: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,

[0201] R^5 是选自以下的基团: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,

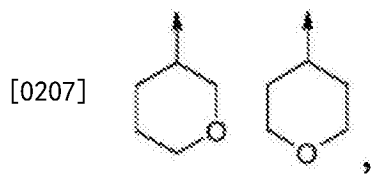
[0202] R^6 是氢或 C_1 - C_4 -烷基,

[0203] R^7 是选自以下的基团: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

[0204] R^6 和 R^7 与它们所键合的氮原子一起形成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,

[0205] R^8 是选自以下的基团: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,在每种情况下任选卤素-取代的 C_1 - C_6 -烷基羰基和 C_1 - C_6 -烷基磺酰基,任选卤素-取代的 C_1 - C_6 -烷氧基羰基,以及任选卤素-、 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,或者是阳离子或任选 C_1 - C_6 -烷基-或芳基- C_1 - C_6 -烷基-取代的铵离子,

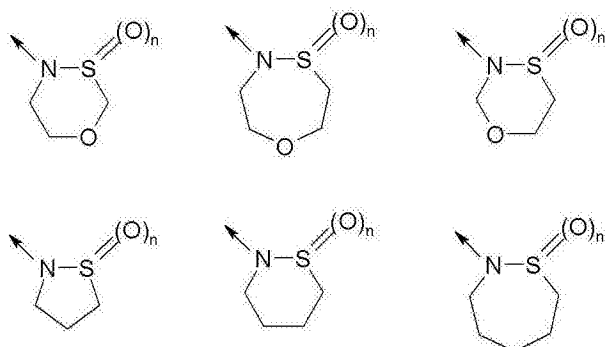
[0206] R^9 是选自以下的基团:在每种情况下任选卤素-、 C_1 - C_4 -烷氧基-、 C_1 - C_4 -卤代烷氧基-、 C_1 - C_4 -烷硫基-、 C_1 - C_4 -卤代烷硫基-、 C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基-、 C_1 - C_4 -卤代烷基亚磺酰基-、 C_1 - C_4 -烷基磺酰基-和 C_1 - C_4 -卤代烷基磺酰基-取代的 C_1 - C_4 -烷基、 C_2 - C_4 -烯基和 C_2 - C_4 -炔基,在每种情况下任选卤素-、 C_1 - C_4 -烷基-、 C_1 - C_4 -卤代烷基-、 C_1 - C_4 -烷氧基-、 C_1 - 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,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(并且在此情况下,尤其是



[0208] 其中箭头在每种情况下表示与(C-1)基团和(F-1)基团中的硫原子键合),在每种情况下任选卤素-、氰基-(包括在烷基部分中的)、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,或者是 $NR'R''$,其中 R' 和 R'' 独立地是选自氢和 C_1 - C_4 -烷基的基团,或者

[0209] (C-1)基团和(F-1)基团中的 R^8 和 R^9 与它们所键合的 $N-S(O)_n$ 基团一起还可形成饱

和或不饱和的且任选卤素-、 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 与它们所键合的N-S(O)_n基团一起可以是选自以下的基团



[0210]

[0211] (其中箭头在每种情况下表示与C(X)基团键合),

[0212] R^{15} 是选自以下的基团:在每种情况下任选甲基-取代的 C_1-C_6 -烷基-、 C_2-C_6 -烯基和 C_2-C_6 -炔基,在每种情况下任选甲基-、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,

[0213] (C-6)基团中的 R^8 和 R^{15} 与它们所键合的N-S(O)_n基团一起还可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,

[0214] R^{17} 是选自以下的基团:在每种情况下任选卤素-、 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,在每种情况下任选卤素-、 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、1-氧化N-硫代吗啉基、1,1-二氧化N-硫代吗啉基、N-哌嗪基、N-1-甲基哌嗪基或N-2-氧-1-甲基哌嗪基,在每种情况下任选卤素-、氰基-(包括在烷基部分中的)、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,或者是 $NR'R''$,其中 R' 和 R'' 独立地是选自氢和 C_1-C_4 -烷基的基团,

[0215] R^{18} 是选自以下的基团:氢,羟基,在每种情况下任选单-或多-卤素-取代的或单-或二-氰基-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-,以及在每种情况下任选单-至三- 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-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，

[0216] R^{19} 是氢，是碱金属或碱土金属离子，或是任选单-至四- C_1-C_4 -烷基-取代的铵离子，或是选自以下的在每种情况下任选单-或多-卤素-取代的或单-或二-氰基-取代的基团： 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，

[0217] Y^3 是选自以下的基团：氢、氟、氯、溴、碘、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 -烷氧基和 C_1-C_4 -卤代烷氧基，

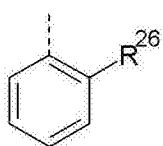
[0218] W是选自以下的基团：S、SO和SO₂，

[0219] 当 R^2 是基团c)时， R^{22} 是选自以下的基团： C_1-C_6 -烷基，任选卤素-、氨基甲酰基-、硫代氨基甲酰基-或氰基-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、 C_1-C_4 -烷硫基- 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、 C_1-C_4 -烷硫基- 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 -卤代烷硫基- 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 -烷硫基- 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 -烯硫基- 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，

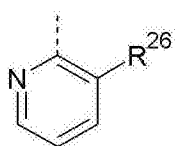
[0220] 当 R^2 是基团c)时， R^{23} 是选自以下的基团：氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_2-C_4 -炔基、 C_1-C_4 -烷硫基- C_1-C_4 -烷基、 C_2-C_4 -烯硫基- C_1-C_4 -烷基、氰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基，

[0221] 当 R^2 是基团d)或e)时， R^{23} 是选自以下的基团：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，或者，在 $R^2=d)$ 的情况下，

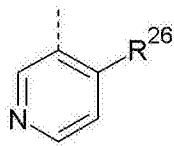
[0222] R^{22} 还是任选卤素-、氰基-、硝基-、氨基-、羟基-、 C_1-C_6 -烷基-、 C_1-C_6 -卤代烷基-、 C_3-C_6 -环烷基-、 C_1-C_6 -烷氧基-、 C_1-C_4 -卤代烷氧基-、 C_1-C_6 -烷氧基羰基-、 C_1-C_6 -烷基氨基-、 C_1-C_6 -烷硫基-、 C_1-C_4 -卤代烷硫基-、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基-、 C_1-C_4 -烷基磺酰基-、 C_1-C_6 -烷基羰基-、氨基羰基-、 C_1-C_6 -烷基氨基羰基-、二- (C_1-C_6 -烷基)-氨基羰基-、 C_1-C_6 -烷基羰基氨基-取代的苯基，或者是选自以下的E基团



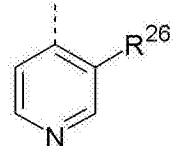
E-1



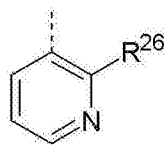
E-2



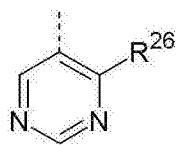
E-3



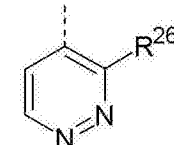
E-4



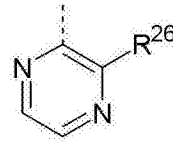
E-5



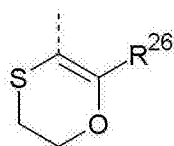
E-6



E-10

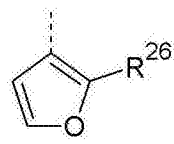


E-11

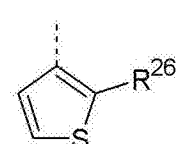


E-13

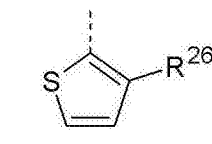
[0223]



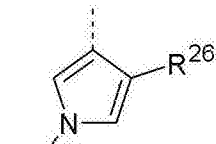
E-18



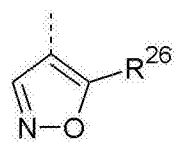
E-21



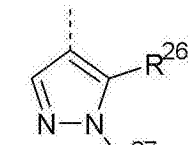
E-23



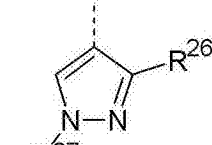
E-25



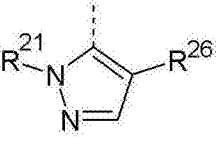
E-27



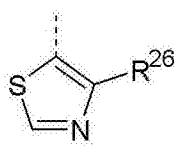
E-31



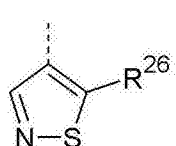
E-35



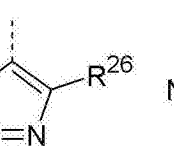
E-36



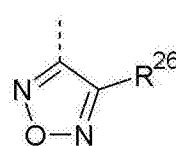
E-39



E-44



E-49



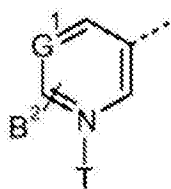
E-51

[0224] R^{27} 是氢或 C_1-C_4 -烷基, 且

[0225] R^{26} 是选自以下的基团: 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。

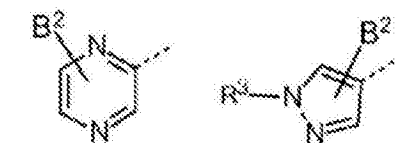
[0226] 优选范围 (3): 非常特别优选这样的式 (I) 的化合物, 其中

[0227] A 是选自 (A-a)、(A-b) 和 (A-f) 的基团



(A-a)

[0228]

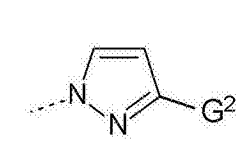


(A-b)

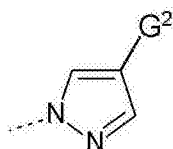
(A-f)

[0229] 其中虚线表示与式(I)的双环体系的氮原子连接的键, G^1 是N或C- B^1 ,[0230] B^1 是选自氢和氟的基团,[0231] B^2 是氢,

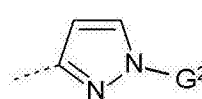
[0232] T是氧或电子对,

[0233] R^1 是氢,[0234] R^2 是选自以下的B基团

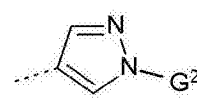
(B-1)



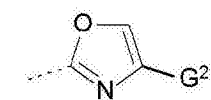
(B-2)



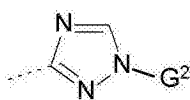
(B-3)



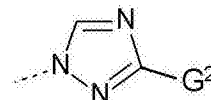
(B-4)



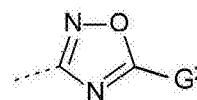
(B-5)



(B-9)

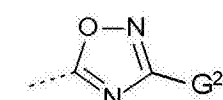


(B-10)

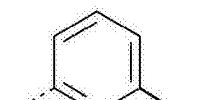


(B-11)

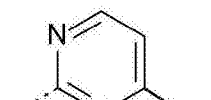
[0235]



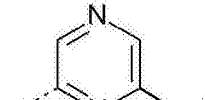
(B-12)



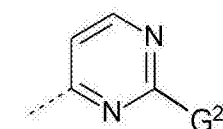
(B-21)



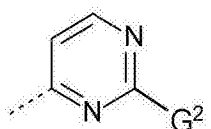
(B-23)



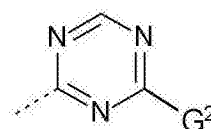
(B-25)



(B-27)



(B-28)

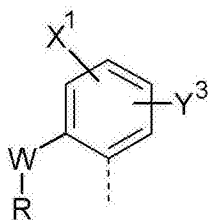


(B-31)

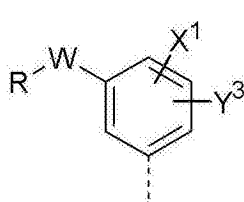
[0236] 其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者

[0237] R^2 是选自 (D-1) 至 (D-3) 的D基团

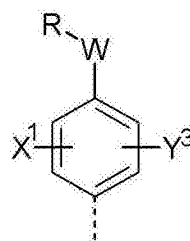
[0238]



(D-1)



(D-2)

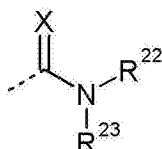


(D-3)

[0239] 其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者

[0240] R^{2c})是下式的基团

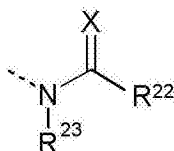
[0241]



[0242] 其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者

[0243] R^{2d})是下式的基团

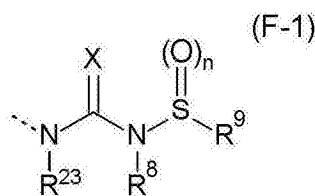
[0244]



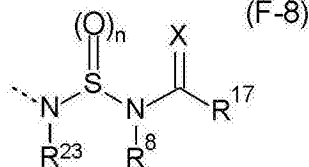
[0245] 其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者

[0246] R^{2e})是选自(F-1)、(F-8)和(F-10)的F基团

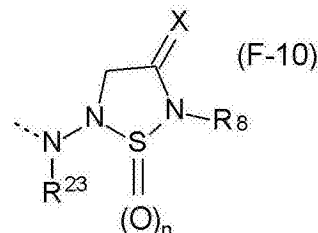
[0247]



(F-1)



(F-8)



(F-10)

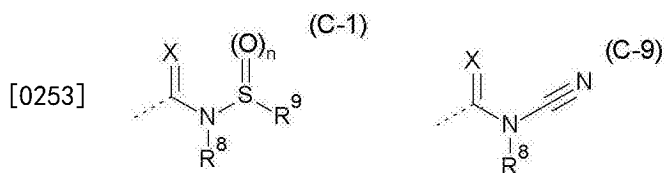
[0248] 其中虚线表示与式(I)的双环体系的碳原子连接的键,或者

[0249] R^{2f})是选自C₁-C₆-卤代烷基、羧基和氨基的基团,其中

[0250] G²是氢或选自以下的基团: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、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基羰基-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、卤代C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、双(C₁-C₄-烷氧基)-C₁-C₄-烷基、双(卤代-C₁-C₄-烷氧基)-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基(C₁-C₄-烷基硫基)-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、双(C₁-C₄-烷基硫基)-C₁-C₄-烷基、双(卤代-C₁-C₄-烷基硫基)-C₁-C₄-烷基、双(羟基-C₁-C₄-烷基硫基)-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-烷基硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基和C₁-C₄-烷基磺酰基,

[0251] 或者

[0252] G²是C基团(C-1)或(C-9)



[0254] 其中虚线表示与B基团连接的键,

[0255] X是氧,

[0256] X^1 是选自以下的基团: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,

[0257] X^2 是氧、硫、 NR^5 或NOH,

[0258] n是2,

[0259] R是 $NR^{18}R^{19}$,或是选自以下的在每种情况下任选单-、二-、三-、四-或五-氟-或-氯-取代的或单-或二-氰基-取代的基团: 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-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-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-或二取代的 C_3 - C_6 -环烷基- 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-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-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-或二取代的杂环基- C_1 - C_2 -烷基,或在每种情况下任选单-或二-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-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,

[0260] R^3 是 C_1 - C_4 -烷基,

[0261] R^4 是选自以下的基团: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,

[0262] R^5 是选自以下的基团: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,

[0263] R^6 是氢或 C_1 - C_4 -烷基,

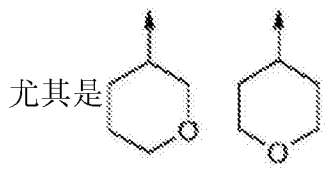
[0264] R^7 是选自以下的基团:氢、 C_1 - C_4 -烷基、卤代- C_1 - C_4 -烷基、氰基- C_1 - C_4 -烷基、 C_2 - C_4 -炔基、 C_1 - C_4 -烷氧基、卤代- C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷硫基- C_1 - C_4 -烷基、芳基- C_1 - C_4 -烷基和杂芳基- C_1 - C_4 -烷基,或者

[0265] R^6 和 R^7 与它们所键合的氮原子一起形成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,

[0266] R^8 是选自以下的基团: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,在每种情况下任选卤素-取

代的C₁-C₆-烷基羰基和C₁-C₆-烷基磺酰基,任选卤素-取代的C₁-C₆-烷氧基羰基,任选卤素-、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,或者是阳离子或任选C₁-C₆-烷基-或芳基-C₁-C₆-烷基-取代的铵离子,

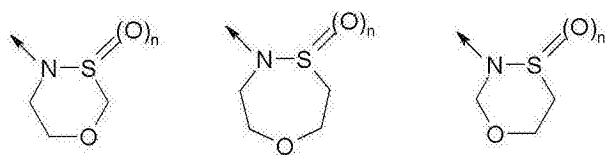
[0267] R⁹是选自以下的基团:在每种情况下任选卤素-、C₁-C₄-烷氧基-、C₁-C₄-卤代烷氧基-、C₁-C₄-烷硫基-、C₁-C₄-卤代烷硫基-、C₁-C₄-烷基亚磺酰基-、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基-、C₁-C₄-烷基磺酰基-和C₁-C₄-卤代烷基磺酰基-取代的C₁-C₄-烷基-、C₂-C₄-烯基和C₂-C₄-炔基,在每种情况下任选卤素-、C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-卤代烷基-、C₁-C₄-烷氧基-、C₁-C₄-卤代烷氧基-取代的C₃-C₆-环烷基-、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基和C₃-C₄-环烯基,其中一个或两个环成员可各自被选自硫、氧(其中氧原子不能彼此直接相邻)和氮的杂原子代替(并且在此情况下,



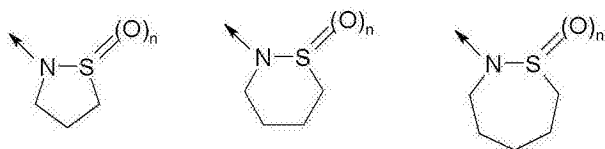
尤其是 其中箭头在每种情况下表示与(C-1)基团和(F-1)基团中的硫原子

键合),在每种情况下任选卤素-、氰基-(包括在烷基部分中的)、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-烷硫基-、C₁-C₄-卤代烷硫基-、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,或者是NR'R'',其中R'和R''独立地是选自氢和C₁-C₄-烷基的基团,

[0268] (C-1)基团和(F-1)基团中的R⁸和R⁹与它们所键合的N-S(O)_n基团一起还可形成饱和或不饱和的且任选卤素-、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与它们所键合的N-S(O)_n基团一起可以是选自以下的基团



[0269]



[0270] (其中箭头在每种情况下表示与C(X)基团键合),

[0271] R¹⁷是选自以下的基团:在每种情况下任选卤素-、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-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,在每种情况下任选卤素-、C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-卤代烷基-、C₁-C₄-烷氧基-、C₁-C₄-卤代烷氧基-

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、1-氧化N-硫代吗啉基、1,1-二氧化N-硫代吗啉基、N-哌嗪基、N-1-甲基哌嗪基或N-2-氧-1-甲基哌嗪基,在每种情况下任选卤素-、氰基-(包括在烷基部分中的)、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-烷硫基-、C₁-C₄-卤代烷硫基-、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,或是NR'R'',其中R'和R''独立地是选自氢和C₁-C₄-烷基的基团,

[0272] W是选自S、SO和SO₂的基团,

[0273] Y³是选自以下的基团: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,

[0274] R¹⁸是选自以下的基团:氢,羟基,在每种情况下任选单-、二-、三-、四-或五-氟-或-氯-取代的或单-或二-氰基-取代的选自C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基-S-C₁-C₂-烷基、C₁-C₄-烷基-S(O)-C₁-C₂-烷基、C₁-C₄-烷基-S(O)₂-C₁-C₂-烷基、C₁-C₄-烷基羰基、C₁-C₄-烷氧基羰基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₃-烷基、杂环基和杂环基-C₁-C₃-烷基的基团,以及在每种情况下任选单-至三-C₁-C₄-烷基-、-C₁-C₃-卤代烷基-、-C₁-C₃-烷氧基-、-C₁-C₃-卤代烷氧基-、-环丙基-、-氟-、-氯-、-溴-或-氰基-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,

[0275] R¹⁹是氢,碱金属或碱土金属离子,任选单-至四-C₁-C₄-烷基-取代的铵离子,或选自以下的在每种情况下任选单-、二-、三-、四-或五-氟-或-氯-取代的或单-或二-氰基-取代的基团: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,

[0276] 当R²是基团c)时,R²²是选自以下的基团:C₁-C₆-烷基,任选氰基-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,

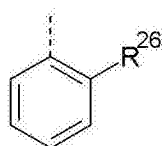
[0277] 当R²是基团c)时,R²³是选自以下的基团:氢、C₁-C₆-烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯硫基-C₁-C₄-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-

C₄-烷基,

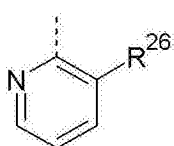
[0278] 当R²是基团d)时,R²²是选自以下的基团:C₁-C₄-烷基,任选氰基-取代的C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷硫基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷硫基-C₂-C₄-烯基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基-C₂-C₄-烯基、C₁-C₄-烷基磺酰基-C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-烯硫基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基亚磺酰基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-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,

[0279] 当R²是基团d)或e)时,R²³是选自以下的基团: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,且在R²=d)的情况下

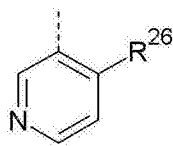
[0280] R²²还是任选卤素-、氰基-、硝基-、氨基-、羟基-、C₁-C₆-烷基-、C₁-C₆-卤代烷基-、C₂-C₆-烯基-、C₂-C₆-炔基-、C₃-C₆-环烷基-、C₁-C₆-烷氧基-、C₁-C₆-卤代烷氧基-、C₃-C₆-烯氧基-、C₃-C₆-炔氧基-、C₁-C₆-烷氧基羰氧基-、C₁-C₆-烷基氨基-、C₃-C₆-烯基氨基-、C₃-C₆-炔基氨基-、C₃-C₆-环烷基氨基-、C₁-C₆-烷硫基-、C₁-C₆-卤代烷硫基-、C₃-C₆-烯硫基-、C₃-C₆-炔硫基-、C₃-C₆-环烷硫基-、C₁-C₆-烷基亚磺酰基-、C₁-C₆-烷基磺酰基-、C₁-C₆-烷基羰基-、氨基羰基-、C₁-C₆-烷基氨基羰基-、二-(C₁-C₆-烷基)-氨基羰基-、C₁-C₆-烷基羰基氨基-取代的苯基,或者是选自以下的E基团



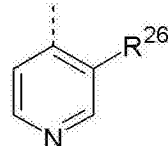
E-1



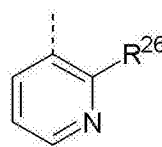
E-2



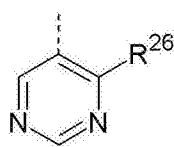
E-3



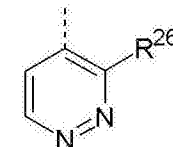
E-4



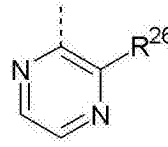
E-5



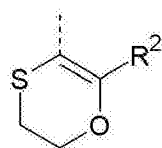
E-6



E-10

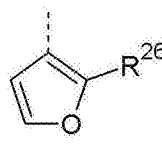


E-11

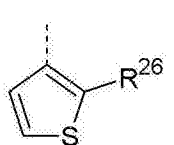


E-13

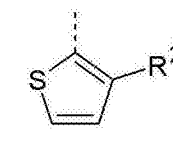
[0281]



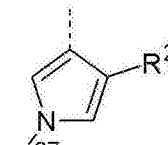
E-18



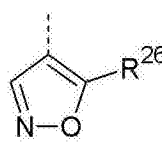
E-21



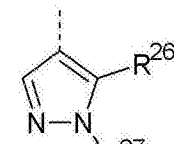
E-23



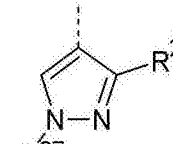
E-25



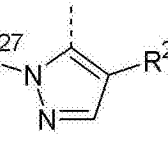
E-27



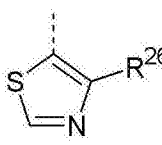
E-31



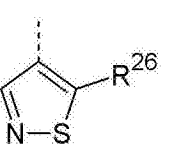
E-35



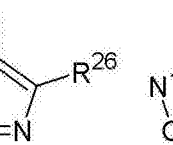
E-36



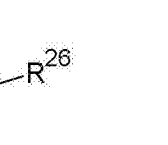
E-39



E-44



E-49



E-51

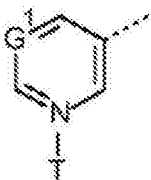
[0282] R^{27} 是氢或甲基, 且

[0283] R^{26} 是选自以下的基团: 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、甲基磺酰基乙基和氰基甲基。

[0284] 优选范围(4): 一组特别的式(I)的化合物为这样的式(I)的化合物, 其中

[0285] A是基团

[0286]



(A-2)

[0287] 其中虚线表示与式 (I) 的双环体系的氮原子连接的键,

[0288] G^1 是 $C-B^1$,[0289] B^1 是氢,

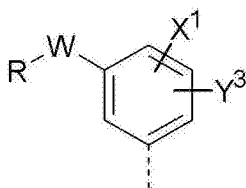
[0290] T 是电子对,

[0291] R^1 是氢,[0292] $R^2a)$ 是

[0293]

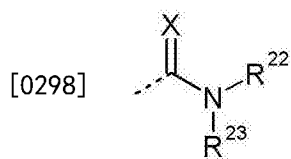
(B-4)

[0294] 其中虚线表示与式 (I) 的双环体系的碳原子连接的键,或者

[0295] $R^2b)$ 是 (D-2) 基团

[0296]

(D-2)

[0297] 其中虚线表示与式 (I) 的双环体系的碳原子连接的键,或者 $R^2c)$ 是下式的基团

[0298]

[0299] 其中虚线表示与式 (I) 的双环体系的碳原子连接的键,或者 G^2 是选自氢和 C_1-C_4 -烷基的基团,

[0300] X 是氧,

[0301] X^1 是选自以下的基团: 氢、氟、氯和溴,[0302] R 是任选单-、二-、三-、四-或五-氟-或-氯-取代的 C_1-C_4 -烷基,[0303] W 是选自 S、SO 和 SO₂ 的基团,[0304] Y^3 是甲基或乙基,[0305] R^{22} 是选自以下的基团: C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基和 C_1-C_4 -烷硫基- C_1-C_4 -烷基,

且

[0306] R^{23} 是氢或 C_1-C_6 -烷基。

[0307] 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(其中氧原子不能直接相邻)和氮的杂原子代替”的表述中,除非另有说明,硫也可以SO或SO₂的形式存在,并且如果氮并非以-N=的形式存在,则除NH形式外还可以N-烷基(尤其是N-C₁-C₆-烷基)的形式存在。

[0308] 在其组合形成优选范围(1)的优选的定义中,除非另有说明:

[0309] 阳离子是选自锂、钠、钾、铷、铯,优选选自锂、钠、钾的碱金属离子,或

[0310] 选自铍、镁、钙、锶、钡,优选选自镁和钙的碱土金属离子,

[0311] 卤素选自氟、氯、溴和碘,优选依次选自氟、氯和溴,

[0312] 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,并且优选是苯基,

[0313] 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)、吡啶基、异吡啶基、吡唑基、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、茶啉基、苯并三嗪基、嘌呤基、蝶啶基和中氮茛基,

[0314] 杂环基是含有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,例如氮杂环丁烷基、氮杂环戊烷基(azolidinyl)、氮杂环己烷基(azinanyl)、氧杂环丁烷基(oxetanyl)、氧杂环戊烷基(oxolanyl)、氧杂环己烷基(oxanyl)、二氧杂环己烷基、硫杂环丁烷基(thiethanyl)、硫杂环戊烷基(thiolanyl)、硫杂环己烷基(thianyl)、四氢呋喃基、哌嗪基、吗啉基。

[0315] 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:

[0316] 阳离子是选自锂、钠、钾、铷、铯,优选选自锂、钠和钾的碱金属离子,或

[0317] 选自铍、镁、钙、锶、钡,优选选自镁和钙的碱土金属离子,

[0318] 卤素选自氟、氯、溴和碘,优选依次选自氟、氯和溴,

[0319] 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,并且优选是苯基,

[0320] 杂芳基(hetaryl)(与杂芳基(heteroaryl)同义,也包括作为较大单元(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,

[0321] 杂环基选自氮杂环丁烷基、氮杂环戊烷基、氮杂环己烷基、氧杂环丁烷基、氧杂环戊烷基、氧杂环己烷基、二氧杂环己烷基、硫杂环丁烷基、硫杂环戊烷基、硫杂环己烷基、四氢呋喃基、哌嗪基、吗啉基。

[0322] 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：

[0323] 阳离子是选自锂、钠、钾、铷、铯，优选选自锂、钠、钾的碱金属离子，或

[0324] 选自铍、镁、钙、锶、钡，优选选自镁和钙的碱土金属离子，

[0325] 杂环基是氧杂环丁烷基、硫杂环丁烷基、四氢呋喃基和吗啉基，

[0326] 芳基是苯基，

[0327] 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) 是选自以下的基团：吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、哒嗪基、噻唑基和吡唑基。

[0328] 在形成优选范围 (4) 的定义中，

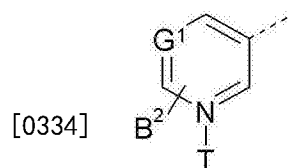
[0329] 卤素是氟、氯、溴和碘，优选依次是氟、氯和溴。

[0330] 卤素-取代的基团 (例如卤代烷基) 是单卤代或多卤代的，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，卤素是氟、氯、溴或碘，尤其是氟、氯或溴。

[0331] 饱和或不饱和的烃基 (例如烷基或烯基) 可各自是直链的或者如可能的话是支链的，包括与杂原子结合的那些，如例如在烷氧基中。

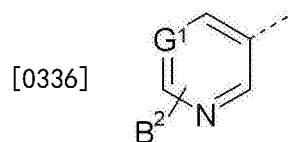
[0332] 除非另有说明，任选取代的基团可以是单取代或多取代的，其中在多取代的情况下，取代基可以相同或不同。

[0333] 当式 (A-a) 的 A 基团中的 T

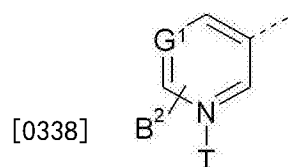


(A-a)

[0335] 是电子对时，所述基团呈下式的吡啶衍生物的形式。

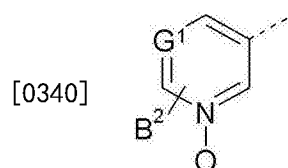


[0337] 当式 (A-a) 的基团 A 中的 T



(A-a)

[0339] 是氧时，所述基团呈下式的吡啶 N-氧化物衍生物的形式。



[0341] 此处省略了对形式电荷 (位于氮上的+和位于氧上的-) 的表示。

[0342] 以一般性术语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起始材料和中间体。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。

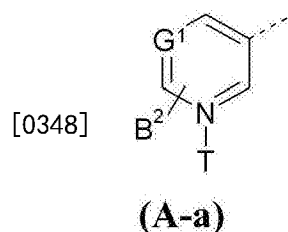
[0343] 根据本发明,优选式(I)的化合物,其包含以上作为优选所列出的定义的组合(优选范围(1))。

[0344] 根据本发明,特别优选式(I)的化合物,其包含以上作为特别优选所列出的定义的组合(优选范围(2))。

[0345] 根据本发明,非常特别优选式(I)的化合物,其包含以上作为非常特别优选所列出的定义的组合(优选范围(3))。

[0346] 根据本发明,尤其优选式(I)的化合物,其包含以上作为具体定义所列出的定义的组合(优选范围(4))。

[0347] 本发明的一个优选的实施方案涉及式(I)的化合物,其中A是式(A-a)的基团。



[0349] 本发明的另一个优选的实施方案涉及式(I)的化合物,其中A是吡啶-3-基。

[0350] 本发明的另一个优选的实施方案涉及式(I)的化合物,其中A是5-氟吡啶-3-基。

[0351] 本发明的另一个优选的实施方案涉及式(I)的化合物,其中A是嘧啶-5-基。

[0352] 本发明的另一个优选的实施方案涉及式(I)的化合物,其中A是哒嗪-4-基。

[0353] 本发明的另一个优选的实施方案涉及式(I)的化合物,其中R²具有在a)中所给出的定义。

[0354] 本发明的另一个优选的实施方案涉及式(I)的化合物,其中R²具有在b)中所给出的定义。

[0355] 本发明的另一个优选的实施方案涉及式(I)的化合物,其中R²具有在c)中所给出的定义。

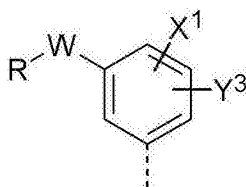
[0356] 本发明的另一个优选的实施方案涉及式(I)的化合物,其中R²具有在d)中所给出的定义。

[0357] 本发明的另一个优选的实施方案涉及式(I)的化合物,其中R²具有在e)中所给出的定义。

[0358] 本发明的另一个优选的实施方案涉及式(I)的化合物,其中R²具有在f)中所给出的定义。

[0359] 本发明的另一个优选的实施方案涉及式(I)的化合物,其中R²是(D-2)基团。

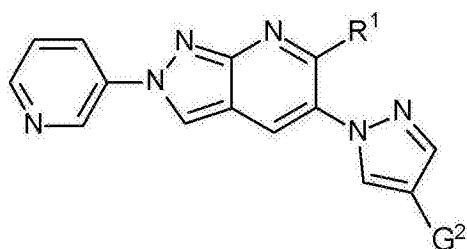
[0360]

**(D-2)**

[0361] 以上以一般性术语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(包括后面所示的式(I-A)至(I-N)的化合物)并适用于起始材料和中间体。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。

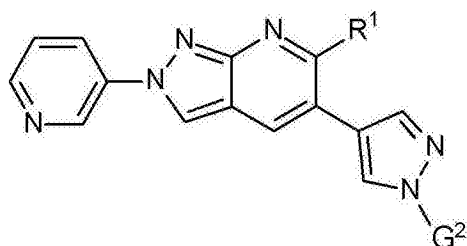
[0362] 在一个优选实施方案中,本发明涉及式(I-A)的化合物

[0363]



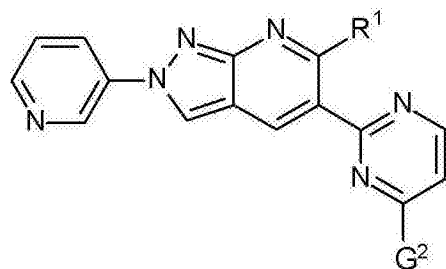
[0364] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式(I-B)的化合物

[0365]



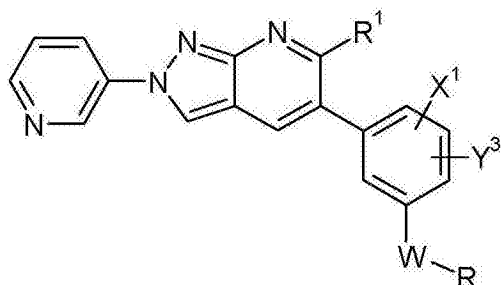
[0366] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式(I-C)的化合物

[0367]



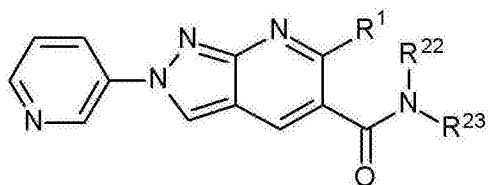
[0368] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式(I-D)的化合物

[0369]



[0370] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式(I-E)的化合物

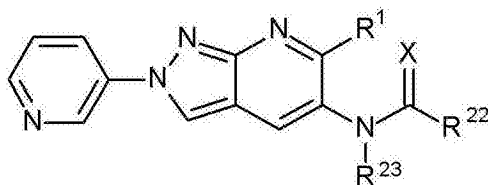
[0371]



[0372]

在另一个优选实施方案中,本发明涉及式(I-F)的化合物

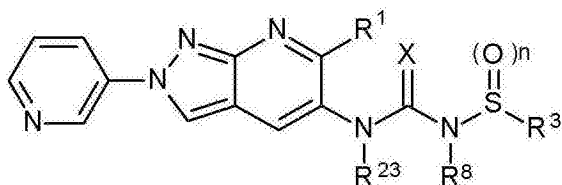
[0373]



[0374]

在另一个优选实施方案中,本发明涉及式(I-G)的化合物

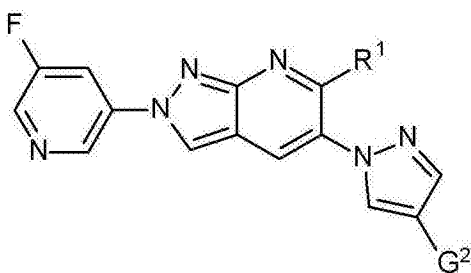
[0375]



[0376]

在一个优选实施方案中,本发明涉及式(I-H)的化合物

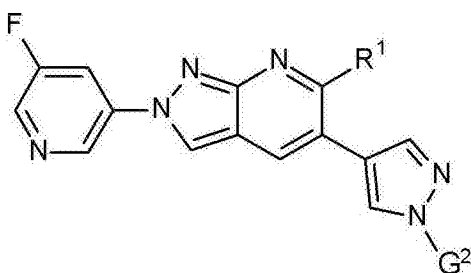
[0377]



[0378]

在另一个优选实施方案中,本发明涉及式(I-I)的化合物

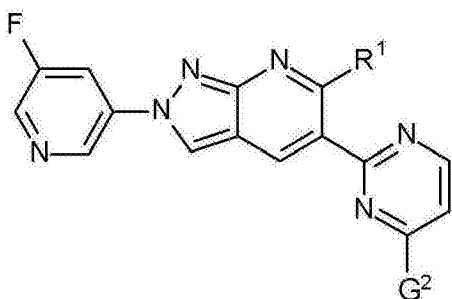
[0379]



[0380]

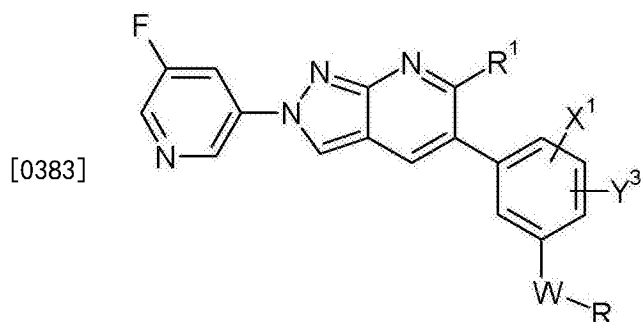
在另一个优选实施方案中,本发明涉及式(I-J)的化合物

[0381]

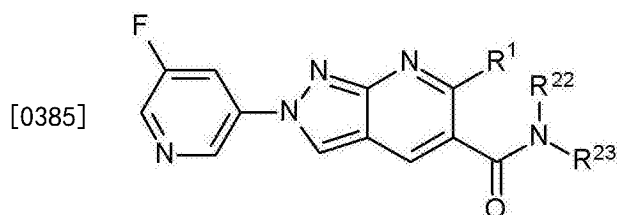


[0382]

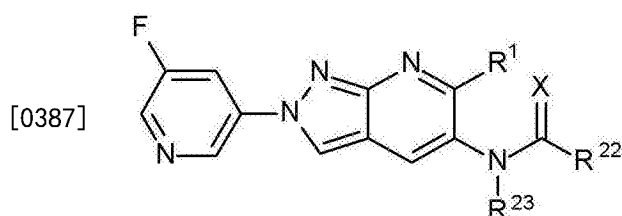
在另一个优选实施方案中,本发明涉及式(I-K)的化合物



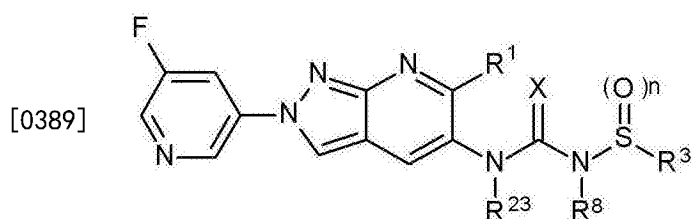
[0384] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式(I-L)的化合物



[0386] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式(I-M)的化合物



[0388] 在另一个优选实施方案中,本发明涉及式(I-N)的化合物



[0390] 在式(I-A)至(I-N)中,变量 G^2 、 R 、 R^1 、 R^3 、 R^8 、 R^{22} 、 R^{23} 、 W 、 X^1 、 Y^3 和 n 具有以上所给出的定义。

[0391] 式(I)的化合物及其加成盐和金属盐络合物特别地对于防治动物害虫(包括节肢动物且尤其是昆虫)具有良好的功效。

[0392] 根据取代基的性质,式(I)的化合物也可以是立体异构体的形式,即几何异构体和/或光学异构体或不同组成的异构体混合物的形式。本发明既提供纯的立体异构体,又提供这些异构体的任何所需混合物,即使在本文中通常仅讨论式(I)的化合物。

[0393] 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。

[0394] 然而,根据本发明,优选使用式(I)的化合物及其盐的光学活性的立体异构形式。

[0395] 可提及的式(I)化合物的合适的盐是常规的无毒盐,即使用适当碱的盐和添加酸的盐。优选无机碱的盐,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;有机碱的盐和无机胺的盐,例如三乙基铵盐、二环己基铵盐、 N,N' -二苄基乙二铵盐、吡啶盐、甲基吡啶盐或乙醇铵盐;无机酸的盐,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;有机羧酸或有机磺酸的

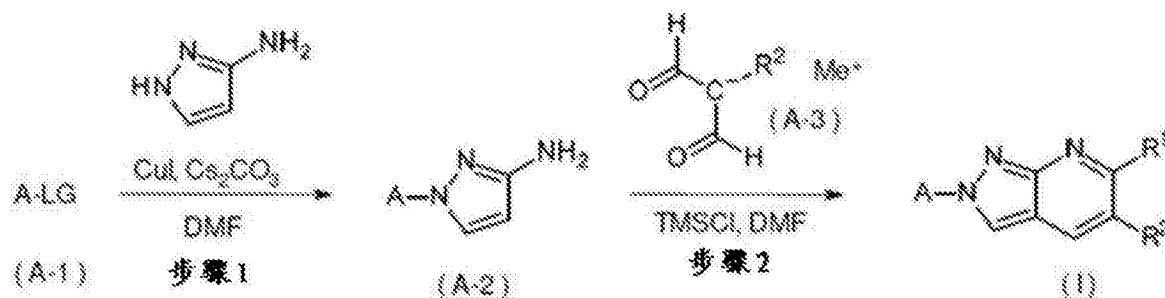
盐,例如甲酸盐、乙酸盐、三氟乙酸盐、马来酸盐、酒石酸盐、甲磺酸盐、苯磺酸盐或对甲苯磺酸盐;碱性氨基酸的盐,例如精氨酸盐、天冬氨酸盐或谷氨酸盐等。

[0396] 此外,已发现式(I)的化合物以及表1中所列的未包括在式(I)中的那些化合物可通过下文所述的方法制备。

[0397] 例如,可根据反应方案I以两步法制备式(I)的化合物,其中杂环A是任选B²基团-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)。

[0398] 反应方案I

[0399]



[0400] Me⁺:碱金属离子,例如Na⁺、K⁺

[0401] 在反应方案I中,除非另有说明,A和R²具有以上所给出的定义;R¹是氢。

[0402] 例如,在第一反应步骤中,可使被合适的离去基团(LG=卤素)取代的式(A-1)的杂环与合适的3-氨基吡唑反应,得到式(A-2)的化合物,然后在第二反应步骤中,使该式(A-2)的化合物环化(例如在三甲基氯硅烷(TMSCl)的存在下,在N,N-二甲基甲酰胺中),形成化合物(I)(参见制备实施例1)。

[0403] 式(A-1)的化合物是市售可得的,或可通过原则上已知的制备方法获得;参见例如,当LG=卤素并且当A=吡嗪-2-基(A-b;B²=H;LG=碘)(WO 2013/159064A1);哒嗪-4-基(A-c;B²=H;LG=碘;A.Seggio等,J.Org.Chem.27,6602-6605,2007);噻唑-5-基(A-d;B²=H;LG=溴、碘)和噻唑-4-基(A-d;B²=H;LG=碘;D.W.Brown等,Science of Synthesis 11,507-572,2002);1-甲基-1H-吡唑-4-基(A-f;B²=H,R³=CH₃;LG=碘;WO 2014/022128 A1)时。

[0404] 式(A-2)的化合物是市售可得的(A=3-吡啶基/Aurora结构单元,A=5-嘧啶基/Otava结构单元;A=2-吡嗪基/Aurora结构单元;A=1-甲基-1H-吡唑-4-基/UORSY结构单元库),或可通过原则上已知的制备方法获得;参见例如,关于1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-3-胺(A-a;B²=H,G¹=C-H;T=电子对;另见制备实施例1,步骤1)。

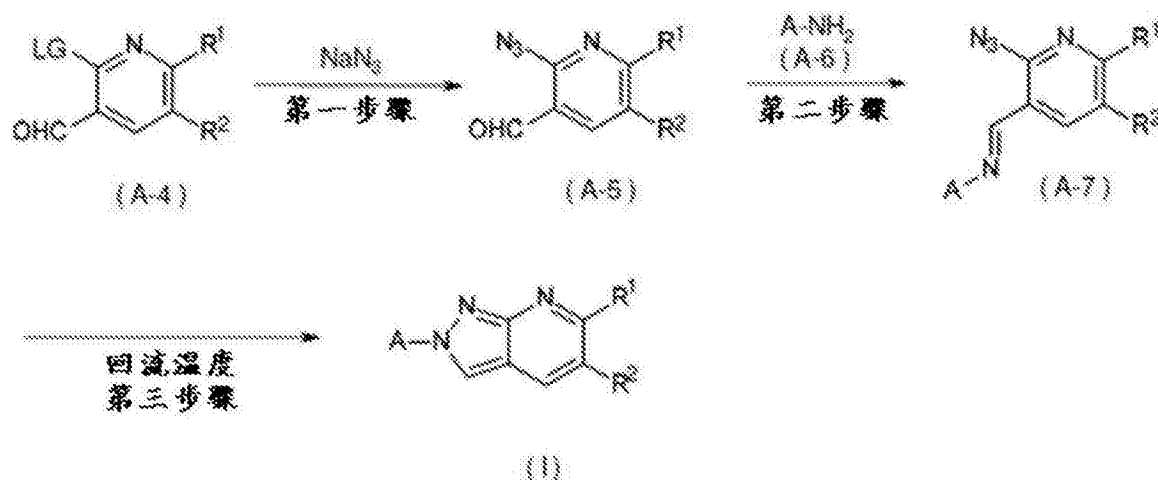
[0405] 式(A-3)的化合物是市售可得的,或可通过原则上已知的制备方法获得;参见例如,关于2-溴丙烷二醇钠(sodium 2-bromopropanediolate)(R²=溴,Me⁺=Na⁺;E.J.Corey等,Tetrahedron Lett.50,4577-4580,1976);2-硝基丙烷二醇钠水合物(sodium 2-nitropropanediolate hydrate)(R²=硝基,Me⁺=Na⁺;参见实验中的中间体合成)。

[0406] 或者,可在第一反应步骤中将式(A-4)的2-卤素-取代的3-吡啶甲醛用叠氮化钠转化为相应的式(A-5)的2-叠氮基-3-吡啶甲醛,然后在第二反应步骤中使该2-叠氮基-3-吡啶甲醛与式(A-6)的3-氨基取代的杂环反应,得到式(A-7)的化合物(称为“席夫碱(Schiff base)”),并在第三反应步骤中使其在回流温度下在合适的溶剂中环化而形成化合物(I)。

(参见例如,关于5-溴-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶(A-a;B²=H,G¹=C-H;T=电子对;另见制备实施例1,步骤1;反应方案II)。

[0407] 反应方案II

[0408]



[0409] 在反应方案II中,除非另有说明,A、R¹和R²具有以上所给出的定义。

[0410] 偶氮甲碱衍生物或氨基-取代杂环的“席夫碱”具有多种应用(例如,其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)。

[0411] 具有合适的离去基团(LG=卤素)的式(A-4)的化合物是市售可得(例如,当R¹=H,R²=CN,6-氟-5-甲酰基烟碱腈(6-fluoro-5-formylnicotinenitrile);R¹=H,R²=COOH,6-氟-5-甲酰基烟酸/Sunshine化学实验室产品列表(Sunshine Chemlab Product List)时),或可通过原则上已知的制备方法获得(例如,当R¹=Cl,R²=H,6-氯-2-氟-3-吡啶甲醛,WO 2012/078608A1;R¹=H,R²=Cl,5-氯-2-氟-3-吡啶甲醛,WO 2012/083117 A1时)。

[0412] 或者,也可以利用不同的反应条件进行环化,例如金属催化的一步法三组分合成(参见M.J.Kumar等,Org.Lett.13,3542-3545,2011及其中所引用的文献)。

[0413] 其中R²是选自(B-1)至(B-34)的基团的式(I)的化合物可以例如由其中R²优选为选自溴和碘的卤素的式(I)的化合物,通过通常已知的方法(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。

[0414] 例如,其中R²是(B-2)、(B-4)或(B-23)基团的式(I)的化合物可根据反应方案III获得。

[0415] 反应方案III

Wiley-VCH, Weinheim, 2004; Ch. O. Ndubaku等, J. Med. Chem., 2013, 56, 4597-4610), 在选自过渡金属盐的合适催化剂的存在下反应, 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。

[0422] 某些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) 是已知的, 或可通过通常已知的方法来制备: 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-1,3,2-二氧杂环戊硼烷-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), $LG=B(OH)_2$, $G^2=H$, US6310095B1]; 5-苯基-1,2,4-噁二唑-3-基硼酸 [(B-13), $LG=B(OH)_2$, $G^2=H$, DE 19710614A1], 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), $LG=B(OH)_2$, $G^2=H$, KR 2011/079401]。

[0423] 或者, 可首先将式 (I-a) 的化合物通过由文献已知的方法转化为式 (I-e) 的化合物, 然后将式 (I-e) 的化合物与卤素-活化的杂环根据反应方案 III, 通过方法 C 进一步反应 (参见 T. Ishiyama等, J. Org. Chem., 1995, 60, 7508-7510; WO 2010/151601)。

[0424] 一些卤素-活化化合物 (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]。

[0425] 其中 R^2 是 (B-21) 或 (B-23) 基团的式 (I) 的化合物的制备可根据方法 B 和 C (由文献已知且示于反应方案 III 中), 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, 例如脂肪族烃或芳族烃。

[0426] 优选使用芳族烃, 例如甲苯。

[0427] 其中 R^2 是 (B-3) 至 (B-9)、(B-11) 至 (B-28) 和 (B-31) 至 (B-33) 基团的式 (I) 的化合物的制备可根据方法 B 和 C (其示于反应方案 III 中), 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。

[0428] 优选的偶联催化剂的实例包括钯催化剂, 如 [1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁]二氯化钯 (II) 或四(三苯基膦)钯。

[0429] 用于进行反应方案 III 的方法的合适的碱性反应助剂优选是碳酸钠或碳酸钾。

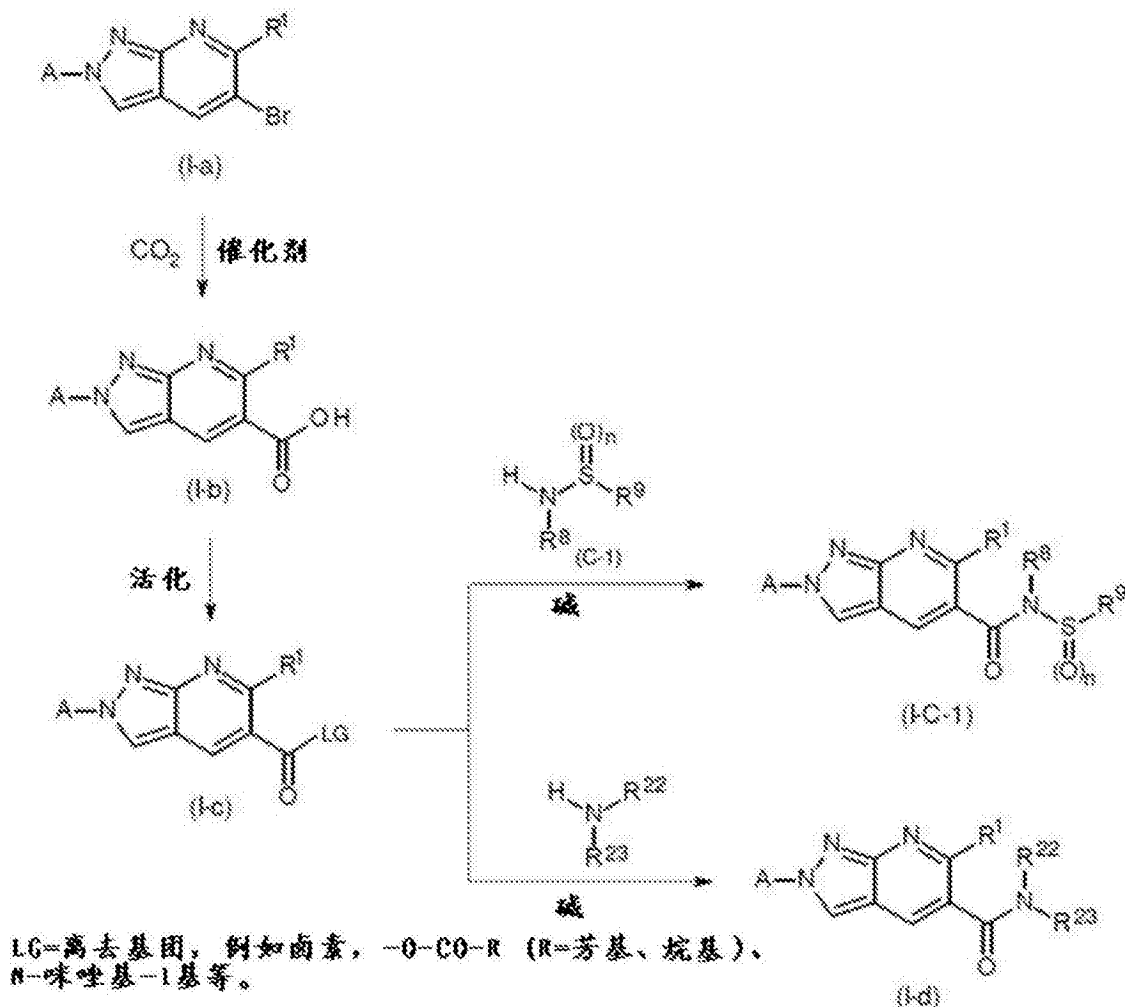
[0430] 优选使用腈或醚, 所述腈例如是乙腈、苄腈, 特别是乙腈; 所述醚例如是二乙醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷, 特别是 1,2-二甲氧基乙烷与水的组合。

[0431] 其中 R^2 是选自 (C-1) 至 (C-9) 的基团或是 $CX-NR^{22}R^{23}$ 的式 (I) 的化合物可通过通常已知的方法, 例如由其中 R^2 是羧基的式 (I) 的化合物, 随后适当活化 (即 LG 是任选原位生成的离核离去基团) 而制备。

[0432] 例如, 其中 R^2 是 (C-1) 基团或是 $-CX-NR^{22}R^{23}$ 的式 (I) 的化合物可根据反应方案 IV 获得。

[0433] 反应方案 IV

[0434]



[0435] 其中R²是羧基的式(I)化合物的合适路线可以根据反应方案I可制备的N-取代的5-溴吡啶并[3,4-b]吡啶(A-1; R²=Br) (参见I-a)。此处, 可将式(I-a)的化合物通过钯催化的羟基羰基化转化成式(I-b)的化合物(参见Korsager等, J. Amer. Chem. Soc. 135, 2891-2894, 2013及其中所引用的综述文章)。

[0436] 用于活化式(I-b)的羧酸的有用的缩合剂包括通常可用于这种酰胺化反应的所有缩合剂。实例包括: 酰基卤形成物, 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-1-甲基碘代吡啶(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、溴代三吡咯烷基磷六氟磷酸盐(BROP)、O-(1H-苯并三唑-1-基氧基)三(二甲基氨基)磷六氟磷酸盐(BOP)、双(2-氧-3-噁唑烷基)次膦酰氯(BOP-Cl)、N,N,N',N'-双(四亚甲基)脲鎓四氟硼酸盐、O-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲鎓六氟磷酸盐(HBTU)、O-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-双(四亚甲基)脲鎓四氟硼酸盐、O-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲鎓四氟硼酸盐(TBTU)、O-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-双(四亚甲基)脲鎓四氟硼酸盐、O-(7-氮杂苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲鎓六氟磷酸盐(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), 通常可作为氯化物获得。这些试剂可单独使用, 或者如果适当也可组

合使用。

[0437] 对于式(I-b)的化合物的受控活化,另一种选择是使用混合酸酐(LG=COOR),这使得可制备式(I-C-1)和(I-d)的化合物(参见G.W.Anderson等,J.Am.Chem.Soc.1967,89,5012-5017)。多种氯甲酸酯可用于该方法中,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)。同样可将二乙基乙酰氯、三甲基乙酰氯及类似化合物用于此目的。

[0438] 根据反应方案IV,式(I-c)的活化化合物与相应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。

[0439] 用于进行反应方案IV的方法的合适的反应助剂是碱性反应助剂。

[0440] 实例包括:锂、钠、钾、镁、钙和钡的氢氧化物、氢化物、氧化物和碳酸盐,以及其它碱性化合物,例如胂碱或胍碱,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、噻啶、吡啶、N,N,N',N'-四亚甲基二胺、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亚乙基二胺。

[0441] 可用于进行反应方案IV的方法的碱性反应助剂可以是任何合适的酸结合剂(例如胺,特别是叔胺)以及碱金属和碱土金属化合物。

[0442] 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)制备式(I-C-1)或(I-d)的化合物。

[0443] 合适的溶剂或稀释剂包括所有的惰性有机溶剂,例如脂肪族烃或芳族烃(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(如二乙醚、二噁烷、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、苯腈)、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、六甲基磷酰三胺)以及二甲基亚砷或水或所述溶剂的混合物。

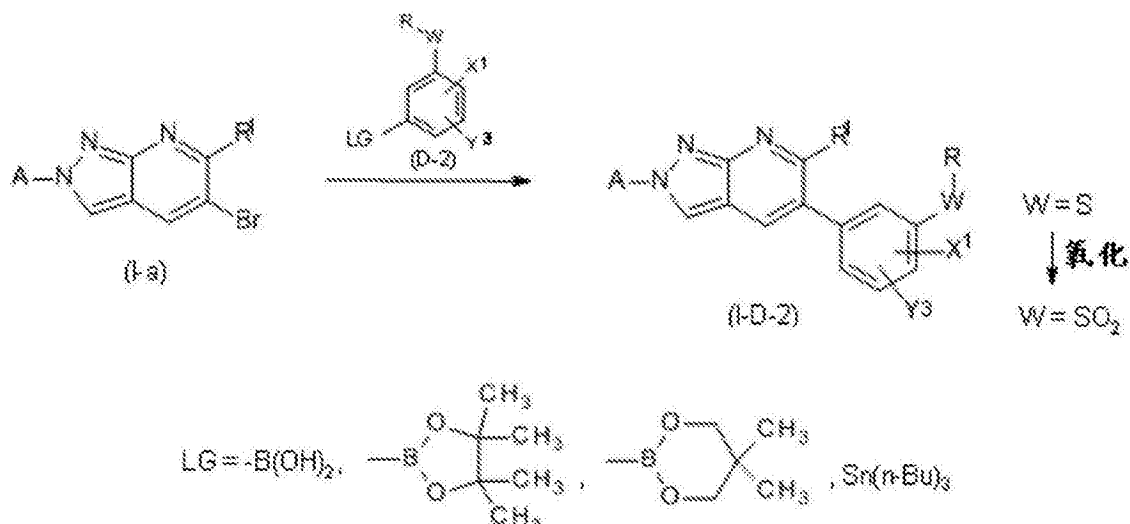
[0444] 优选使用酰胺作为溶剂,例如N,N-二甲基甲酰胺。

[0445] 其中R²是选自(D-1)至(D-3)的基团的式(I)的化合物可通过已知的方法,例如由其中R²是溴或碘的式(I)的化合物制备。

[0446] 例如,其中R²是选自(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)。

[0447] 反应方案V

[0448]



[0449] 在反应方案V中,其中W是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。

[0450] 例如,可以使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)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;Tetrahedron 2002,58,9633-9695;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。

[0451] 其中R²是(D-1)至(D-3)基团的式(I)的化合物的制备可根据反应方案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。

[0452] 优选的偶联催化剂的实例包括钯催化剂,如[1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁]二氯化钯(II)或四(三苯基膦)钯。

[0453] 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。

[0454] 优选使用腈(例如乙腈、苄腈,特别是乙腈)或醚(例如二乙醚、二噁烷、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)(同样参见制备实施例2和3)。

[0455] 对其中W是硫的式(I-D-2)化合物中的硫的后续氧化,产生其中W是SO或SO₂的式(I-D-2)的化合物(参见反应方案V;见关于(I-D-2)的制备实施例3和5)。

[0456] 其中W是SO(亚砷)或SO₂(砷)的式(I)的化合物可由其中W是S(硫醚)的式(I)的化合物通过由文献已知的方法进行氧化(例如通过氧化剂在合适的溶剂或稀释剂中)来制备。合适的氧化剂是,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是惰性有机溶剂,通常是乙腈和卤代溶剂(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)。

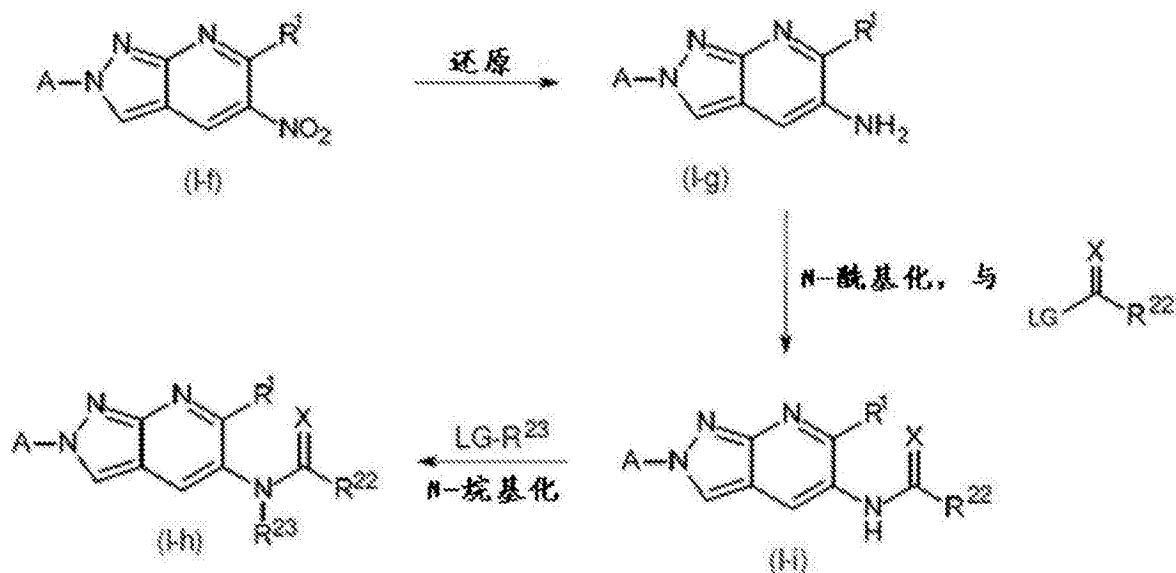
[0457] 多种方法适用于制备富含对映异构体的亚砷,如G.E.O' Mahony等在ARKIVOC(Gainesville,FL,United states),2011,1,1-110中所记载:例如使用作为最常用催化剂来源的钛或钒(以Ti(OⁱPr)₄或VO(acac)₂的形式)连同手性配体和氧化剂(如叔丁基氢过氧化物(TBHP)、2-苯基丙-2-基氢过氧化物(CHP)或过氧化氢)对硫醚进行的金属催化的不对称氧化;通过使用手性氧化剂或手性催化剂的非金属催化的不对称氧化;电化学或生物不

对称氧化;以及亚砷的动力学拆分和亲核置换(通过Andersen方法)。

[0458] 其中 R^2 是 $-NR^{23}-CX-R^{22}$ 的式(I)化合物可例如由其中 R^2 是式 $-NHR^{23}$ 的基团的式(I)化合物,通过使用式 $LG-CX-R^{22}$ 的活化化合物(其中LG是任选原位生成的离核离去基团)进行N-酰化反应而获得。

[0459] 根据反应方案VI,这些其中 R^2 是 $-NHR^{23}$ 的式(I)的化合物可通过已知的方法,由其中 R^2 是硝基的式(I)的化合物(参见I-f)通过还原成其中 R^2 是氨基的式(I)的化合物(参见I-g)来制备(同样参见关于A=3-吡啶基, $R^1=H$ 的制备实施例1;步骤4)。

[0460]



LG=离去基团, 例如卤素

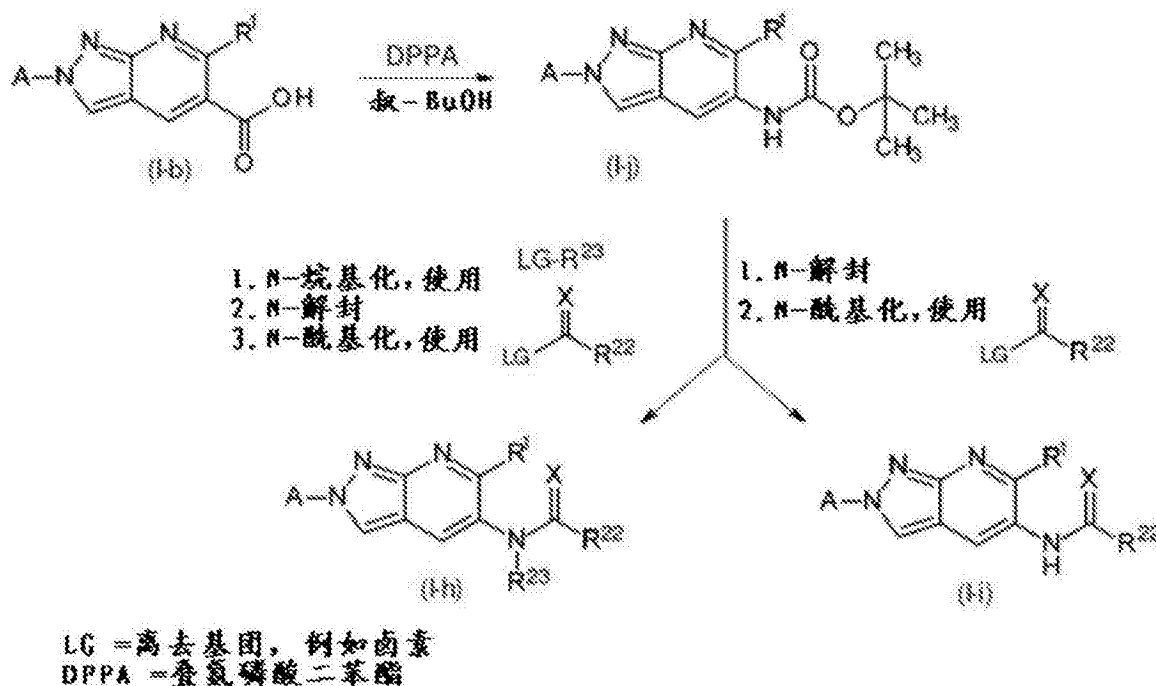
[0461] 式(I-i)的化合物可通过式(I-j)的化合物的N-酰基化来获得(参见制备实施例7和8)。

[0462] 式(I-h)的化合物可由化合物(I-i)例如通过后续的N-烷基化来制备。

[0463] 或者,根据反应方案VII,其中 R^2 是 $-NHR^{23}$ 的式(I)的化合物可通过通常已知的方法,由其中 R^2 是羧基的式(I)的化合物来制备。

[0464] 反应方案VII

[0465]



[0466] 例如, 式 (I-f) 的化合物可以通过如例如在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。

[0467] 在此情况下, 式 (I-b) 的化合物可例如与叠氮磷酸二苯酯 (DPPA) 在叔丁醇的存在下直接反应, 得到式 (I-j) 的化合物。

[0468] 通常, 为了除去保护基团, 可根据文献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、二噁烷、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和/或有机溶剂如乙酸乙酯的混合物。

[0469] 当下文中述及式 (I) 的化合物时, 也包括表1中的未包括在式 (I) 中的那些化合物。

[0470] 异构体

[0471] 根据取代基的性质, 式 (I) 的化合物可以是几何异构体和/或光学活性异构体或不同组成的相应异构体混合物的形式。这些立体异构体为, 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, 本发明包括纯的立体异构体以及这些异构体的任何所需的混合物。

[0472] 方法和用途

[0473] 本发明还涉及用于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以及材料保护中进行。这优选排除用于人体或动物体的手术性或治疗性处理的方法以及对人体或动物体进行的诊断方法。

[0474] 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。

[0475] 在本申请的上下文中, 术语“农药”还始终包括术语“作物保护剂”。

[0476] 鉴于良好的植物耐受性、对温血动物有利的毒性和良好的环境相容性,式(I)的化合物适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、畜牧业、水产养殖业、林业、花园和休闲设施、储存产品和材料保护以及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。它们对于通常敏感的和具有抗性的物种以及对于所有或特定的发育阶段有效。上述害虫包括:

[0477] 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*)、桔芽瘿螨(*Aceria sheldoni*);刺皮节痹属种(*Aculops* spp.);刺锈螨属种(*Aculus* spp.),例如佛氏刺瘿螨(*Aculus fockeui*)、苹果刺锈螨(*Aculus schlechtendali*);钝眼痹属种(*Amblyomma* spp.);山楂叶螨(*Amphitetranynchus viennensis*);锐缘痹属种(*Argas* spp.);牛痹属种(*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(*Chorioptes* spp.);鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*);屋尘螨(*Dermatophagoides pteronyssinus*)、粉尘螨(*Dermatophagoides farinae*);革痹属种(*Dermacentor* spp.);始叶螨属种(*Eotetranychus* spp.),例如核桃始叶螨(*Eotetranychus hicoriae*);梨上瘿螨(*Epitrimerus pyri*);真叶螨属种(*Eutetranychus* spp.),例如柑橘褐蜘蛛(*Eutetranychus banksi*);瘿螨属种(*Eriophyes* spp.),例如梨上瘿螨(*Eriophyes pyri*);家食甜螨(*Glycyphagus domesticus*);红足土螨(*Halotydeus destructor*);半跗线螨属种(*Hemitarsonemus* spp.),例如茶半跗线螨(*Hemitarsonemus latus*) (=侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonemus latus*));璃眼痹属种(*Hyalomma* spp.);硬痹属种(*Ixodes* spp.);盗蛛属种(*Latrodectus* spp.);斜蛛属种(*Loxosceles* spp.);秋收恙螨(*Neutrombicula autumnalis*);*Nuphresa*属种;小爪螨属种(*Oligonychus* spp.),例如咖啡小爪螨(*Oligonychus coffeae*)、*Oligonychus coniferarum*、冬青小爪螨(*Oligonychus ilicis*)、*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*);钝缘痹属种(*Ornithodoros* spp.);禽刺螨属种(*Ornithonyssus* spp.);全爪螨属种(*Panonychus* spp.),例如桔全爪螨(*Panonychus citri*) (= *Metatetranychus citri*)、苹果全爪螨(*Panonychus ulmi*) (= *Metatetranychus ulmi*);柑橘锈螨(*Phyllocoptruta oleivora*);*Platytetranychus multidigituli*;侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonemus latus*);痒螨属种(*Psoroptes* spp.);扇头痹属种(*Rhipicephalus* spp.);根嗜螨属种(*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.),例如乱跗线螨(*Tarsonemus confusus*)、白跗线螨(*Tarsonemus pallidus*);叶螨属种(*Tetranychus* spp.),例如四点红蜘蛛(*Tetranychus canadensis*)、红叶螨(*Tetranychus cinnabarinus*)、土耳其斯坦叶螨(*Tetranychus turkestanii*)、二斑叶螨(*Tetranychus urticae*);阿氏真恙螨(*Trombicula alfreddugesi*);*Vaejovis*属种;番茄刺皮瘿螨(*Vasates lycopersici*);

[0478] 唇足纲(Chilopoda)的害虫,例如地蜈蚣属种(*Geophilus* spp.)、蚰蜒属种

(*Scutigera* spp.);

[0479] 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*);

[0480] 倍足纲(*Diplopoda*)的害虫,例如具斑马陆(*Blaniulus guttulatus*);

[0481] 昆虫纲(*Insecta*),例如蜚蠊目(*Blattodea*)的害虫,例如:东方蜚蠊(*Blatta orientalis*);亚洲蜚蠊(*Blattella asahinai*)、德国蜚蠊(*Blattella germanica*);马德拉蜚蠊(*Leucophaea maderae*);*Loboptera decipiens*;家屋斑蠊(*Neostylopyga rhombifolia*);古巴蠊属种(*Panchlora* spp.);木蠊属种(*Parcoblatta* spp.);大蠊属种(*Periplaneta* spp.),例如美洲大蠊(*Periplaneta americana*)、澳洲大蠊(*Periplaneta australasiae*);苏里南潜蠊(*Pycnoscelus surinamensis*);棕带蜚蠊(*Supella longipalpa*);

[0482] 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.),例如*Agriotes linneatus*、小麦金针虫(*Agriotes mancus*);小粉虫(*Alphitobius diaperinus*);马铃薯鳃角金龟(*Amphimallon solstitialis*);家具窃蠹(*Anobium punctatum*);星天牛属种(*Anoplophora* spp.);花象属种(*Anthonomus* spp.),例如墨西哥棉铃象虫(*Anthonomus grandis*);圆皮蠹属种(*Anthrenus* spp.);长喙小象属种(*Apion* spp.);甘蔗金龟属种(*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.);菜豆莹叶甲(*Cerotoma trifurcata*);象甲属种(*Ceutorrhynchus* spp.),例如白菜籽龟象(*Ceutorrhynchus assimilis*)、*Ceutorrhynchus quadridens*、*Ceutorrhynchus rapae*;凹胫跳甲属种(*Chaetocnema* spp.),例如甘薯叶甲(*Chaetocnema confinis*)、*Chaetocnema denticulata*、*Chaetocnema ectypa*; *Cleonus mendicus*;宽胸叩头虫属种(*Conoderus* spp.);根颈象属种(*Cosmopolites* spp.),例如香蕉根茎象(*Cosmopolites sordidus*);褐新西兰肋翅鳃角金龟(*Costelytra zealandica*);叩甲属种(*Ctenicera* spp.);象虫属种(*Curculio* spp.),例如核桃象甲(*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*)、北方玉米根虫(*Diabrotica barberi*)、十一星叶甲食根亚虫(*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、十一星黄瓜甲虫(*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*)、西部玉米根虫(*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;*Epicaerus*属种;食植瓢虫属种(*Epilachna* spp.),例如南瓜瓢虫(*Epilachna borealis*)、墨西哥豆象(*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 psylloides*);阔角谷盗(*Gnathocerus cornutus*);菜心螟(*Hellula undalis*);黑异爪蔗金龟(*Heteronychus arator*);寡节鳃金龟属种(*Heteronyx* spp.);*Hylamorpha elegans*;北美家天牛(*Hylotrupes bajulus*);紫苜蓿叶象(*Hypera postica*);蓝绿象(*Hypomeces squamosus*);咪小蠹属种(*Hypothenemus* spp.),例如咖啡果小蠹(*Hypothenemus hampei*)、苹枝小囊(*Hypothenemus obscurus*)、*Hypothenemus pubescens*;甘蔗大褐齿爪鳃金龟(*Lachnosterna consanguinea*);烟草甲(*Lasioderma serricorne*);长头谷盗(*Latheticus oryzae*);*Lathridius*属种;合爪负泥虫属种(*Lema* spp.);马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata*);潜叶蛾属种(*Leucoptera* spp.),例如咖啡潜叶蛾(*Leucoptera coffeella*);稻根象(*Lissorhoptrus oryzophilus*);卜象(*Listronotus*) (= *Hyperodes*) 属种;筒喙象属种(*Lixus* spp.);黄胸叶甲(*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*;油菜花露尾甲(*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.);象甲(*Naupactus xanthographus*);隐跗郭公虫属种(*Necrobia* spp.);*Neogalerucella*属种;黄蛛甲(*Niptus hololeucus*);椰蛀犀金龟(*Oryctes rhinoceros*);锯谷盗(*Oryzaephilus surinamensis*);*Oryzaphagus oryzae*;黑葡萄耳象属种(*Otiorhynchus* spp.),例如*Otiorhynchus cribricollis*、*Otiorhynchus ligustici*、草莓耳喙象(*Otiorhynchus ovatus*)、草莓根耳喙象(*Otiorhynchus rugosostriatus*)、黑葡萄耳象(*Otiorhynchus sulcatus*);束颈金花虫属种(*Oulema* spp.),例如黑角负泥虫(*Oulema melanopus*)、水稻负泥虫(*Oulema oryzae*);小青花金龟(*Oxycetonia jucunda*);辣根猿叶甲(*Phaedon cochleariae*);鳃角金龟属种(*Phyllophaga* spp.),*Phyllophaga helleri*;条跳甲属种(*Phyllotreta* spp.),例如辣根菜跳甲(*Phyllotreta armoraciae*)、柔弱黑跳甲(*Phyllotreta pusilla*)、*Phyllotreta ramosa*、黄曲条菜跳甲(*Phyllotreta striolata*);日本丽金龟(*Popillia japonica*);象甲属种(*Premnotrypes* spp.);大谷蠹(*Prostephanus truncatus*);蚤跳甲属种(*Psylliodes* spp.),例如*Psylliodes affinis*、油菜金头跳甲(*Psylliodes chrysocephala*)、*Psylliodes punctulata*;蛛甲属种(*Ptinus* spp.);暗色瓢虫(*Rhizobius ventralis*);谷蠹(*Rhizopertha dominica*);隐喙象属种(*Rhynchophorus* spp.),红棕象甲(*Rhynchophorus ferrugineus*)、棕榈象甲(*Rhynchophorus palmarum*);*Sinoxylon perforans*;米象属种(*Sitophilus* spp.),例如麦子象鼻虫(*Sitophilus granarius*)、*Sitophilus linearis*、米象(*Sitophilus oryzae*)、玉米象(*Sitophilus zeamais*);尖隐喙象属种(*Sphenophorus* spp.);药材甲(*Stegobium paniceum*);茎干象属种(*Sternechus* spp.),例如豆茎象(*Sternechus paludatus*);*Symphyletes*属种;纤毛象属种(*Tanymecus* spp.),例如*Tanymecus dilaticollis*、*Tanymecus indicus*、*Tanymecus palliatus*;黄粉虫(*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*Zabrus tenebrioides*;

[0483] 革翅目(Dermaptera)的害虫,例如*Anisolabis maritime*、欧洲球蠊(*Forficula auricularia*)、溪岸蠊(*Labidura riparia*);

[0484] 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*)、*Agromyza parvicornis*;按实蝇属种(*Anastrepha* spp.);按蚊属种(*Anopheles* spp.),例如四斑按蚊(*Anopheles quadrimaculatus*)、冈比亚按蚊(*Anopheles gambiae*);瘿蚊属种(*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*)、红头丽蝇(*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*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*);嗜人瘤蝇(*Cordylobia anthropophaga*);*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.);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*);人皮蝇(*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.);麻虻属种(*Haematopota* spp.);毛眼水蝇属种(*Hydrellia* spp.);大麦水蝇(*Hydrellia griseola*);种蝇属种(*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*);*Paratanytarsus*属种;*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*)、核桃绕

实蝇 (*Rhagoletis completa*)、黑樱桃实蝇 (*Rhagoletis fausta*)、西部樱桃实蝇 (*Rhagoletis indifferens*)、蓝橘绕实蝇 (*Rhagoletis mendax*)、苹果实蝇 (*Rhagoletis pomonella*)；麻蝇属种 (*Sarcophaga* spp.)；蚋属种 (*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*)；木瓜馓实蝇 (*Toxotrypana curvicauda*)；

[0485] 半翅目 (*Hemiptera*) 的害虫，例如：*Acizzia acaciaebaileyanae*、*Acizzia dodonaeae*、*Acizzia uncatoides*；长头蝗 (*Acrida turrita*)；无网长管蚜属种 (*Acyrtosiphon* spp.)，例如碗豆长管蚜 (*Acyrtosiphon pisum*)；*Acrogonia* 属种；沫蝉属种 (*Aeneolamia* spp.)；隆脉木虱属种 (*Agonosцена* spp.)；刺粉虱属种 (*Aleurocanthus* spp.)；欧洲甘蓝粉虱 (*Aleyrodes proletella*)；甘蔗穴粉虱 (*Aleurolobus barodensis*)；软毛粉虱 (*Aleurothrixus floccosus*)；*Allocaridara malayensis*；芒果叶蝉属种 (*Amrasca* spp.)，例如 *Amrasca bigutulla*、叶蝉 (*Amrasca devastans*)；飞廉短尾蚜 (*Anuraphis cardui*)；肾圆盾介壳虫属种 (*Aonidiella* spp.)，例如橘红肾圆盾介壳虫 (*Aonidiella aurantii*)、黄圆蹄盾蚧 (*Aonidiella citrina*)、赤圆介壳虫 (*Aonidiella inornata*)；苏联黄粉蚜 (*Aphanostigma piri*)；蚜属种 (*Aphis* spp.)，例如苹果黄蚜 (*Aphis citricola*)、豆蚜 (*Aphis craccivora*)、甜菜蚜 (*Aphis fabae*)、*Aphis forbesi*、大豆蚜 (*Aphis glycines*)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)、*Aphis hederæ*、*Aphis illinoisensis*、*Aphis middletoni*、鼠李马铃薯蚜 (*Aphis nasturtii*)、夹竹桃蚜 (*Aphis nerii*)、苹果蚜 (*Aphis pomi*)、绣线菊蚜 (*Aphis spiraecola*)、*Aphis viburniphila*；葡萄叶蜂 (*Arboridia apicalis*)；*Arytainilla* 属种；小圆盾蚧属种 (*Aspidiella* spp.)；薄圆盾介壳虫属种 (*Aspidiotus* spp.)，例如常春藤圆盾蚧 (*Aspidiotus nerii*)；*Atanus* 属种；茄沟无网蚜 (*Aulacorthum solani*)；烟粉虱 (*Bemisia tabaci*)；*Blastopsylla occidentalis*；*Boreioglycaspis melaleucae*；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；黄头大叶蝉 (*Carneocephala fulgida*)；甘蔗绵蚜 (*Ceratovacuna lanigera*)；沫蝉科 (*Cercopidae*)；蜡蚧属种 (*Ceroplastes* spp.)；草莓钉蚜 (*Chaetosiphon fragaefolii*)；蔗黄雪盾蚧 (*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*)；玉米叶蝉 (*Cicadulina mbila*)；*Cocomytilus 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；*Ctenarytaina* 属种；角顶叶蝉属种 (*Dalbulus* spp.)；*Dialeurodes chittendeni*、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；草履介壳虫属种 (*Drosicha* spp.)；西圆尾蚜属种 (*Dysaphis* spp.)，例如 *Dysaphis apiifolia*、车前圆尾蚜 (*Dysaphis plantaginea*)、百合西圆尾蚜 (*Dysaphis tulipae*)；灰粉蚧属种 (*Dysmicoccus* spp.)；小绿叶蝉属种

(*Empoasca* spp.), 例如 *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*)、*Eriosoma pyricola*; 斑叶蝉属种 (*Erythroneura* spp.); *Eucalyptolyma* 属种; 褐木虱属种 (*Euphyllura* spp.); *Euscelis bilobatus*; 拂粉蚧属种 (*Ferrisia* spp.); 围盾介壳虫属种 (*Fiorinia* spp.); *Furcaspis oceanica*; 咖啡地粉蚧 (*Geococcus coffeae*); *Glycaspis* 属种; 银合欢木虱 (*Heteropsylla cubana*)、*Heteropsylla spinulosa*; 假桃病毒叶蝉 (*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*); 片角叶蝉属种 (*Idiocerus* spp.); 扁喙叶蝉属种 (*Idioscopus* spp.); 灰飞虱 (*Laodelphax striatellus*); 蜡蚧属种 (*Lecanium* spp.), 例如褐盔蜡蚧 (*Lecanium corni*) (= *Parthenolecanium corni*); 牡蛎蚧属种 (*Lepidosaphes* spp.), 例如榆蛎盾蚧 (*Lepidosaphes ulmi*); 萝卜蚜 (*Lipaphis erysimi*); 长白盾蚧 (*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 lilii*、蔷薇长管蚜 (*Macrosiphum rosae*); 二点叶蜂 (*Macrostes facifrons*); 突眼长蝽属种 (*Mahanarva* spp.); 高粱蚜 (*Melanaphis sacchari*); *Metcalfiella* 属种; *Metcalfa pruinosa*; 麦无网蚜 (*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*)、*Myzus cerasi*、*Myzus ligustri*、*Myzus ornatus*、桃蚜 (*Myzus persicae*)、烟蚜 (*Myzus nicotianae*); 葛苳衲长管蚜 (*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*; 稻褐飞虱 (*Nilaparvata lugens*); *Oncometopia* 属种; *Orthezia praelonga*; 中华稻蝗 (*Oxya chinensis*); *Pachypsylla* 属种; 杨梅缘粉虱 (*Parabemisia myricae*); 木虱属种 (*Paratrioza* spp.), 例如 *Paratrioza cockerelli*; 片盾蚧属种 (*Parlatoria* spp.); 瘿绵蚜属种 (*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*); 杨平翅绵蚜 (*Phloeomyzus passerinii*); 忽布疣蚜 (*Phorodon humuli*); 葡萄根瘤蚜属种 (*Phylloxera* spp.), 例如 *Phylloxera devastatrix*、*Phylloxera notabilis*; 苏铁褐点并盾蚧 (*Pinnaspis aspidistrae*); 臀纹粉蚧属种 (*Planococcus* spp.), 例如桔臀纹粉蚧 (*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*、苹果木虱 (*Psylla mali*)、梨木虱 (*Psylla pyri*); 金小蜂属种 (*Pteromalus* spp.); 绵蜡蚧属种 (*Pulvinaria* spp.); *Pyrilla* 属种; 笠圆盾蚧属种 (*Quadraspidotus* spp.), 例如胡桃圆盾蚧 (*Quadraspidotus juglansregiae*)、*Quadraspidotus ostreaeformis*、梨圆盾蚧

(*Quadraspidiotus perniciosus*); *Quesada gigas*; 平刺粉蚧属种 (*Rastrococcus* spp.); 缢管蚜属种 (*Rhopalosiphum* spp.), 例如玉米蚜 (*Rhopalosiphum maidis*)、*Rhopalosiphum oxyacanthae*、禾谷缢管蚜 (*Rhopalosiphum padi*)、红腹缢管蚜 (*Rhopalosiphum rufiabdominale*); 黑盔蚧属种 (*Saissetia* spp.), 例如咖啡硬介壳虫 (*Saissetia coffeae*)、*Saissetia miranda*、*Saissetia neglecta*、橄榄黑盔蚧 (*Saissetia oleae*); 葡萄带叶蝉 (*Scaphoideus titanus*); 麦二叉蚜 (*Schizaphis graminum*); 苏铁刺圆盾蚧 (*Selenaspidus articulatus*); 牛鞭草蚜 (*Sipha flava*); 麦长管蚜 (*Sitobion avenae*); 长唇基飞虱属种 (*Sogatata* spp.); 白背飞虱 (*Sogatella furcifera*); *Sogatodes* 属种; 三角蝶 (*Stictocephala festina*); 树粉虱 (*Siphoninus phillyreae*); *Tenalaphara malayensis*; *Tetragonocephala* 属种; 美洲山核桃长斑蚜 (*Tinocallis caryaefoliae*); 广胸沫蝉属种 (*Tomaspis* spp.); 声蚜属种 (*Toxoptera* spp.), 例如小桔蚜 (*Toxoptera aurantii*)、大桔蚜 (*Toxoptera citricidus*); 温室白粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*); 尖翅木虱属种 (*Trioza* spp.), 例如 *Trioza diospyri*; 小叶蝉属种 (*Typhlocyba* spp.); 尖盾蚧属种 (*Unaspis* spp.); 葡萄根瘤虱 (*Viteus vitifolii*); 么叶蝉属种 (*Zygina* spp.);

[0486] 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*、*Euschistus variolarius*; 菜蝽属种 (*Eurydema* spp.); 扁盾蝽属种 (*Eurygaster* spp.); 茶翅蝽 (*Halyomorpha halys*); 刺盲蝽属种 (*Heliopeltis* spp.); *Horcias nobilellus*; 稻缘蝽属种 (*Leptocorisa* spp.); 异稻缘蝽 (*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*、豆荚盲蝽 (*Lygus hesperus*)、牧草盲蝽 (*Lygus lineolaris*); 蔗黑长蝽 (*Macropes excavatus*); 筛豆龟蝽 (*Megacopta cribraria*); 盲蝽科 (*Miridae*); 黑摩盲蝽 (*Monalonion atratum*); 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*; 方背皮蝽 (*Piesma quadrata*); 壁蝽属种 (*Piezodorus* spp.), 例如 *Piezodorus guildinii*; 杂盲蝽属种 (*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; 锥猎蝽属种 (*Triatoma* spp.);

[0487] 膜翅目 (*Hymenoptera*) 的害虫, 例如: 顶切叶蚁属种 (*Acromyrmex* spp.); 残青叶蜂属种 (*Athalia* spp.), 例如芜菁叶蜂 (*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*)；小家蚁(*Monomorium pharaonis*)；立毛蚁属种(*Paratrechina* spp.)；*Paravespula*属种；斜结蚁属种(*Plagiolepis* spp.)；*Sirex*属种；红火蚁(*Solenopsis invicta*)；蚁属种(*Tapinoma* spp.)；白足狡臭蚁(*Technomyrmex albipes*)；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.)；

[0488] 等足目(*Isopoda*)的害虫，例如鼠妇虫(*Armadillidium vulgare*)、栉水虱(*Oniscus asellus*)、球鼠妇(*Porcellio scaber*)；

[0489] 等翅目(*Isoptera*)的害虫，例如：家白蚁属种(*Coptotermes* spp.)，例如台湾乳白蚁(*Coptotermes formosanus*)；堆角白蚁(*Cornitermes cumulans*)；堆砂白蚁属种(*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.)，例如黄肢散白蚁(*Reticulitermes flavipes*)、西方散白蚁(*Reticulitermes hesperus*)；

[0490] 鳞翅目(*Lepidoptera*)的害虫，例如：小蜡螟(*Achroia grisella*)；桑剑纹夜蛾(*Acronicta major*)；褐带卷蛾属种(*Adoxophyes* spp.)，例如棉褐带卷蛾(*Adoxophyes orana*)；烦夜蛾(*Aedia leucomelas*)；地老虎属种(*Agrotis* spp.)，例如黄地老虎(*Agrotis segetum*)、小地老虎(*Agrotis ipsilon*)；波纹夜蛾属种(*Alabama* spp.)，例如棉叶波纹夜蛾(*Alabama argillacea*)；脐橙螟蛾(*Amyelois transitella*)；条麦蛾属种(*Anarsia* spp.)；干煞夜蛾属种(*Anticarsia* spp.)，例如大豆夜蛾(*Anticarsia gemmatilis*)；条小卷蛾属种(*Argyroproctis* 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.)；卷叶蛾属种(*Cacoecia* spp.)；茶细蛾(*Caloptilia theivora*)；烟卷蛾(*Capua reticulana*)；苹果蠹蛾(*Carpocapsa pomonella*)；桃蛀果蛾(*Carpocapsa 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；小卷蛾属种(*Cydia* spp.)，例如豌豆小卷蛾(*Cydia nigricana*)、苹果小卷蛾(*Cydia pomonella*)；*Dalaca noctuides*；绢野螟属种(*Diaphania* spp.)；*Diparopsis*属种；小蔗螟(*Diatraea saccharalis*)；钻夜蛾属种(*Earias* spp.)；*Ecdytolopha aurantium*；南美玉米苗斑螟(*Elasmopalpus lignosellus*)；非洲蔗螟(*Eldana saccharina*)；粉斑螟属种(*Ephestia* spp.)，例如烟草粉螟(*Ephestia elutella*)、地中海粉螟(*Ephestia kuehniella*)；叶小卷蛾属种(*Epinotia* spp.)；苹淡褐卷蛾(*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.)，例如褐尾蠹(*Euproctis*

chrysorrhoea);切夜蛾属种(*Euxoa* spp.);脏切夜蛾属种(*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*)、玉米穗虫(*Helicoverpa zea*);实夜蛾属种(*Heliothis* spp.),例如烟芽夜蛾(*Heliothis virescens*);褐织蛾(*Hofmannophila pseudospretella*);同斑螟属种(*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.);贪夜蛾属种(*Laphygma* spp.);*Laspeyresia molesta*;茄黄斑螟蛾(*Leucinodes orbonalis*);潜叶蛾属种(*Leucoptera* spp.),例如咖啡潜叶蛾(*Leucoptera coffeella*);潜叶细蛾属种(*Lithocolletis* spp.),例如*Lithocolletis blancardella*;绿果冬夜蛾(*Lithophane antennata*);花翅小卷蛾属种(*Lobesia* spp.),例如葡萄花翅小卷蛾(*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.),例如桃潜蛾(*Lyonetia clerkella*);黄褐天幕毛虫(*Malacosoma neustria*);豆荚野螟(*Maruca testulalis*);甘蓝夜蛾(*Mamestra brassicae*);暮眼蝶(*Melanitis leda*);毛胫夜蛾属种(*Mocis* spp.);*Monopis obviella*;东方粘虫(*Mythimna separata*);*Nemapogon cloacellus*;水螟属种(*Nymphula* spp.);*Oiketicus*属种;楸螟属种(*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.),例如欧洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis*);小眼夜蛾(*Panolis flammea*);稻弄蝶属种(*Parnara* spp.);红铃虫属种(*Pectinophora* spp.),例如棉红铃虫(*Pectinophora gossypiella*);潜跳甲属种(*Perileucoptera* spp.);块茎蛾属种(*Phthorimaea* spp.),例如马铃薯块茎蛾(*Phthorimaea operculella*);桔潜蛾(*Phyllocnistis citrella*);小潜细蛾属种(*Phyllonorycter* spp.),例如斑幕潜叶蛾(*Phyllonorycter blancardella*)、*Phyllonorycter crataegella*;菜粉蝶属种(*Pieris* spp.),例如菜青虫(*Pieris rapae*);荷兰石竹小卷蛾(*Platynota stultana*);印度谷蛾(*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.);烟草天蛾属种(*Protoparce* spp.);粘虫属种(*Pseudaletia* spp.),例如一星粘虫(*Pseudaletia unipuncta*);大豆尺夜蛾(*Pseudoplusia includens*);玉米螟(*Pyrausta nubilalis*);薄荷灰夜蛾(*Rachiplusia nu*);禾螟属种(*Schoenobius* spp.),例如*Schoenobius bipunctifer*;白禾螟属种(*Scirpophaga* spp.),例如稻白螟(*Scirpophaga innotata*);黄地老虎(*Scotia segetum*);蛀茎夜蛾属种(*Sesamia* spp.),例如大螟(*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*;举肢蛾属种(*Stathmopoda* spp.);*Stenoma*属种;花生麦蛾(*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.);大显夜蛾(*Thermesia gemmatalis*);木塞谷蛾(*Tinea cloacella*)、袋谷蛾(*Tinea pellionella*);幕谷蛾(*Tineola bisselliella*);

栎绿卷蛾属种 (*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.);

[0491] 直翅目 (*Orthoptera*) 或跳跃目 (*Saltatoria*) 的害虫, 例如家蟋 (*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*; *Paratlanticus ussuriensis*; 沙漠蝗 (*Schistocerca gregaria*);

[0492] 虱目 (*Phthiraptera*) 的害虫, 例如畜虱属种 (*Damalinea* spp.)、血虱属种 (*Haematopinus* spp.)、毛虱属种 (*Linognathus* spp.)、虱属种 (*Pediculus* spp.)、*Phylloxera vastatrix*、阴虱 (*Phthirus pubis*)、嚼虱属种 (*Trichodectes* spp.);

[0493] 啮虫目 (*Psocoptera*) 的害虫, 例如粉啮虫属种 (*Lepinotus* spp.)、书虱属种 (*Liposcelis* spp.);

[0494] 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*)、猫栉头蚤 (*Ctenocephalides felis*); 扰蚤 (*Pulex irritans*); 穿皮潜蚤 (*Tunga penetrans*); 印鼠客蚤 (*Xenopsylla cheopsis*);

[0495] 缨翅目 (*Thysanoptera*) 的害虫, 例如: 玉米黄呆蓟马 (*Anaphothrips obscurus*); 稻蓟马 (*Baliothrips biformis*); *Chaetanaphothrips leeuweni*; 鲜食葡萄镰蓟马 (*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*)、苏花蓟马 (*Frankliniella schultzei*)、东方花蓟马 (*Frankliniella tritici*)、*Frankliniella vaccinii*、威廉期花蓟马 (*Frankliniella williamsi*); 简管蓟马属种 (*Haplothrips* spp.); 阳蓟马属种 (*Heliothrips* spp.); 温室条篱蓟马 (*Hercinothrips femoralis*); 卡蓟马属种 (*Kakothrips* spp.); 葡萄蓟马 (*Rhipiphorothrips cruentatus*); 硬蓟马属种 (*Scirtothrips* spp.); *Taeniothrips cardamomi*; 蓟马属种 (*Thrips* spp.), 例如南黄蓟马 (*Thrips palmi*)、葱蓟马 (*Thrips tabaci*);

[0496] 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*)、小灶衣鱼 (*Thermobia domestica*);

[0497] 综合纲 (*Symphyla*) 的害虫, 例如: 么蚰属种 (*Scutigera* spp.), 例如白松虫 (*Scutigera immaculata*);

[0498] 软体动物门 (*Mollusca*), 特别是双壳纲 (*Bivalvia*) 的害虫, 例如贻贝属种 (*Dreissena* spp.);

[0499] 以及腹足纲 (*Gastropoda*) 的害虫, 例如: 阿勇蛞蝓属种 (*Arion* spp.), 例如黑蛞蝓 (*Arion ater rufus*); 双脐螺属种 (*Biomphalaria* spp.); 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.); 福寿螺属种 (*Pomacea* spp.); 琥珀螺属种 (*Succinea* spp.);

[0500] 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*)、巴西钩口线虫 (*Ancylostoma braziliensis*); 管圆线虫属种 (*Angiostrongylus* spp.); 异尖线虫属种 (*Anisakis* spp.); 裸头绦虫属种 (*Anoplocephala* spp.); 蛔虫属种 (*Ascaris* spp.); 鸡蛔虫属种 (*Ascaridia* spp.); 贝利蛔虫属种 (*Baylisascaris* spp.); 布鲁线虫属种 (*Brugia* spp.), 例如马来布鲁线虫 (*Brugia malayi*)、帝汶布鲁线虫 (*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.); 支睾吸虫属种 (*Clonorchis* spp.); 古柏线虫属种 (*Cooperia* spp.); 环体线虫属种 (*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*); 裂头绦虫属种 (*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*); 棘球绦虫属种 (*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*); 真鞘属种 (*Eucoleus* spp.); 片形吸虫属种 (*Fasciola* spp.); 拟片形吸虫属种 (*Fascioloides* spp.); 姜片吸虫属种 (*Fasciolopsis* spp.); 类丝虫属种 (*Filaroides* spp.); 筒线虫属种 (*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*); 猪圆线虫属种 (*Hyostromylus* 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 (*Mesocetoides* spp.); 蒙尼茨绦虫属种 (*Moniezia* spp.); 缪勒线虫属种 (*Muellerius* spp.); 板口线虫属种 (*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*); 后睾吸虫属种 (*Opisthorchis* spp.); 奥斯勒线虫属种 (*Oslerus* spp.); 奥斯特线虫属种 (*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.); 同端盘吸虫属种 (*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.), 例如福氏类圆线虫 (*Strongyloides fuelleborni*)、粪类圆线虫 (*Strongyloides stercoralis*); 圆线虫属种 (*Strongylus* spp.); 开口虫属种 (*Syngamus* spp.); 绦虫属种 (*Taenia* spp.), 例如牛肉绦虫 (*Taenia*

saginata)、猪肉绦虫(*Taenia solium*);背带线虫属种(*Teladorsagia* spp.);吸吮线虫属种(*Thelazia* spp.);弓蛔线虫属种(*Toxascaris* spp.);弓蛔虫属种(*Toxocara* spp.);毛线虫属种(*Trichinella* spp.),例如旋毛虫(*Trichinella spiralis*)、本地毛形线虫(*Trichinella nativa*)、布氏旋毛虫(*Trichinella britovi*)、南方旋毛虫(*Trichinella nelsoni*)、*Trichinella pseudospiralis*;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*);

[0501] 线虫门的植物害虫,即植物寄生性线虫,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*Belonolaimus gracilis*、芹刺线虫(*Belonolaimus longicaudatus*)、*Belonolaimus nortoni*;伞滑刃线虫属种(*Bursaphelenchus* spp.),例如椰子红环腐线虫(*Bursaphelenchus cocophilus*)、*Bursaphelenchus eremus*、松材线虫(*Bursaphelenchus xylophilus*);坏死线虫属种(*Cacopaurus* spp.),例如胡桃线虫(*Cacopaurus pestis*);小环线虫属种(*Criconemella* spp.),例如弯曲小环线虫(*Criconemella curvata*)、*Criconemella onoensis*、装饰小环线虫(*Criconemella ornata*)、*Criconemella rusium*、异盘中环线虫(*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.),例如双宫螺旋线虫(*Helicotylenchus dihystra*);半轮线虫属种(*Hemicriconemoides* spp.);鞘线虫属种(*Hemicycliophora* spp.);异皮线虫属种(*Heterodera* spp.),例如燕麦异皮胞囊线虫(*Heterodera avenae*)、大豆胞囊线虫(*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*Longidorus africanus*;根结线虫属种(*Meloidogyne* spp.),例如哥伦比亚根结线虫(*Meloidogyne chitwoodi*)、*Meloidogyne fallax*、北方根结线虫(*Meloidogyne hapla*)、南方根结线虫(*Meloidogyne incognita*);*Meloinema*属种;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.);拟滑刃线虫属种(*Paraphelenchus* spp.);拟毛刺线虫属种(*Paratrichodorus* spp.),例如微小拟毛刺线虫(*Paratrichodorus minor*);针线虫属种(*Paratylenchus* spp.);短体线虫属种(*Pratylenchus* spp.),例如穿刺短体线虫(*Pratylenchus penetrans*);*Pseudohalenchus*属种;*Psilenchus*属种;*Punctodera*属种;五沟线虫属种(*Quinisulcius* spp.);穿孔线虫属种(*Radopholus* spp.),例如柑橘穿孔线虫(*Radopholus citrophilus*)、香蕉穿孔线虫(*Radopholus similis*);肾状线虫属种(*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 *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*);垫刃线虫属种(*Tylenchulus* spp.),例如半穿刺线虫(*Tylenchulus semipenetrans*);剑线虫属种(*Xiphinema* spp.),例如剑线虫(*Xiphinema index*)。

[0502] 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.)。

[0503] 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。视情况,它们还可用作合成其他活性成分的中间体或前体。

[0504] 制剂

[0505] 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,所述使用形式还包含农药和/或改善作用的佐剂如渗透剂,例如植物油(例如油菜籽油、葵花籽油),矿物油(例如石蜡油),植物脂肪酸的烷基酯(例如油菜籽油甲酯或大豆油甲酯)或烷醇烷氧基化物;和/或展着剂(spreader),例如烷基硅氧烷和/或盐,例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/或保湿剂,例如甘油;和/或肥料,例如含有铵、钾或磷的肥料。

[0506] 常规的制剂是例如水溶性液体剂(SL)、乳液浓缩剂(EC)、水包乳剂(EW)、悬浮浓缩剂(SC、SE、FS、OD)、水分散性颗粒剂(WG)、颗粒剂(GR)和胶囊浓缩剂(CS);这些制剂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与保护文献-173(FAO Plant Production and Protection Papers-173)(由联合国粮农组织/世界卫生组织关于农药手册的联合会议制订,2004,ISBN:9251048576)。除一种或多种式(I)的化合物外,所述制剂还任选地包含其他农用化学活性成分。

[0507] 优选包含助剂例如增量剂、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)的制剂或使用形式。在本上下文中,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。佐剂的实例是这样的试剂:其促进保持、扩散、附着到叶子表面或渗透。

[0508] 这些制剂以已知的方式制备,例如通过将式(I)的化合物与助剂(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)混合。所述制剂在合适的设施中制备,或在施用之前或施用过程中制备。

[0509] 所使用的助剂可为这样的物质:其适合于将特定的特性如特定的物理、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备的使用形式(例如即用型(ready-to-use)农药,如喷液或拌种产品)。

[0510] 合适的增量剂是例如水、极性和非极性有机化学液体,例如选自:芳族和非芳族烃

(如石蜡、烷基苯、烷基萘、氯苯)、醇和多元醇(如合适,其也可被取代、醚化和/或酯化)、酮(如丙酮、环己酮)、酯(包括脂肪和油)和(聚)醚、简单的和取代的胺、酰胺、内酰胺(如N-烷基吡咯烷酮)和内酯、砒和亚砒(如二甲基亚砒)。

[0511] 如果所使用的增量剂是水,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是:芳族化合物,如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯化芳族烃或氯化脂族烃,如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,如环己烷或石蜡(例如矿物油馏分、矿物油和植物油);醇(如丁醇或乙二醇)及其醚和酯;酮,如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂,如二甲基甲酰胺和二甲基亚砒;以及水。

[0512] 原则上,可以使用所有合适的溶剂。合适的溶剂的实例是:芳族烃,如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯化芳族烃或氯化脂族烃,如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,如环己烷、石蜡、矿物油馏分、矿物油和植物油;醇,如甲醇、乙醇、异丙醇、丁醇或乙二醇以及它们的醚和酯;酮,如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂,如二甲基亚砒;以及水。

[0513] 原则上,可以使用所有合适的载体。有用的载体尤其包括:例如铵盐和粉碎的天然矿物(如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、绿坡缕石、蒙脱石或硅藻土),和粉碎的合成矿物(如细分散的二氧化硅、氧化铝),以及天然或合成的硅酸盐、树脂、蜡和/或固体肥料。同样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(如方解石、大理石、浮石、海泡石、白云石),和无机和有机粉的合成颗粒,以及有机材料(如锯屑、纸、椰壳、玉米穗轴和烟草秆)的颗粒。

[0514] 还可使用液化的气体增量剂或溶剂。尤其合适的是在标准温度和大气压力下为气态的那些增量剂或载体,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。

[0515] 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是:聚丙烯酸的盐;木素磺酸的盐;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);聚乙氧基化醇或酚的磷酸酯;多元醇的脂肪酸酯;以及含硫酸酯、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、蛋白质水解产物、木素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。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施用,则表面活性剂的存在是有利的。

[0516] 可存在于制剂和源自其的使用形式中的其他助剂是染料,如无机颜料例如氧化铁、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;以及营养物和痕量营养物如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐。

[0517] 另外可存在的组分可以是稳定剂(如低温稳定剂)、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂或改进化学和/或物理稳定性的其他试剂。还可存在发泡剂(foam generator)或消泡剂。

[0518] 此外,所述制剂和源自其的使用形式还可包含以下物质作为另外的助剂:粘着剂(sticker),如羧甲基纤维素;以及粉末、颗粒或胶乳形式的天然和合成聚合物,如阿拉伯树胶、聚乙烯醇和聚乙酸乙烯酯;或者天然磷脂(如脑磷脂和卵磷脂)和合成磷脂。其他的助剂可以是矿物油和植物油。

[0519] 如合适,所述制剂和源自其的使用形式中还可存在其他助剂。这类添加剂的实例是香料、保护胶体、粘合剂、胶粘剂、增稠剂、触变剂、渗透剂、保持促进剂、稳定剂、多价螯合

剂(sequestrant)、络合剂、保湿剂、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或液体添加剂结合。

[0520] 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(例如磺基琥珀酸二辛酯)或提高粘弹性的物质(例如羟丙基瓜尔胶聚合物)。

[0521] 在本发明的上下文中,有用的渗透剂是所有那些常用于促进农用化学活性成分向植物内渗透的物质。在本上下文中,通过其自(通常为水性)施用液体和/或自喷雾涂层渗入植物表皮中从而增加活性成分在表皮中迁移的能力来定义渗透剂。可以采用文献(Baur等,1997,Pesticide Science 51,131-152)中记载的方法来测定该特性。实例包括:醇烷氧基化物,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,例如油菜籽油甲酯或大豆油甲酯;脂肪胺烷氧基化物,例如牛油胺乙氧基化物(15);或铵盐和/或磷盐,例如硫酸铵或磷酸氢二铵。

[0522] 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0.01重量%至95重量%的式(I)的化合物,最优选0.5重量%至90重量%的式(I)的化合物,基于该制剂的重量计。

[0523] 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的范围内变化。式(I)的化合物在使用形式中的浓度通常可为0.00000001重量%至95重量%的式(I)的化合物,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。

[0524] 混合物

[0525] 式(I)的化合物还可以与一种或多种合适的杀真菌剂、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(beneficial organisms)、除草剂、肥料、鸟驱避剂、植物性毒素(phytotoxic)、止繁殖剂(sterilant)、安全剂、信息化学物质和/或植物生长调节剂的混合物的形式使用,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,这种类型的活性成分的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)、干旱或含水量增加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。

[0526] 此外,式(I)的化合物可以与其他活性成分或信息化学物质如引诱剂和/或鸟驱避剂和/或植物激活剂和/或生长调节剂和/或肥料的混合物的形式存在。同样,式(I)的化合物可以与改善植物特性(例如生长、产量和采收物的品质)的试剂的混合物的形式使用。

[0527] 在本发明的一个具体实施方案中,在制剂或由这些制剂制备的使用形式中,式(I)的化合物以与其他化合物——优选如下文所述的那些——的混合物的形式存在。

[0528] 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,即使在每种情况下没有明确提及。

[0529] 杀昆虫剂/杀螨剂/杀线虫剂

[0530] 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 Council 2012中,或可在互联网上检索到(例如<http://www.alanwood.net/pesticides>)。

[0531] (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)、胺甲萘 (carbaryl)、虫螨威 (carbofuran)、丁硫克百威 (carbosulfan)、乙硫苯威 (ethiofencarb)、仲丁威 (fenobucarb)、伐虫脒 (formetanate)、呋线威 (furathiocarb)、异丙威 (isoprocarb)、灭虫威 (methiocarb)、灭多虫 (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)、啉蚜威 (triazamate)、混杀威 (trimethacarb)、XMC 和灭杀威 (xylylcarb); 或有机磷酸酯类, 例如乙酰甲胺磷 (acephate)、甲基吡恶磷 (azamethiphos)、乙基谷硫磷 (azinphos-ethyl)、甲基谷硫磷 (azinphos-methyl)、硫线磷 (cadusafos)、氯氧磷 (chlorethoxyfos)、毒虫畏 (chlorfenvinphos)、氯甲硫磷 (chlormephos)、毒死蜱 (chlorpyrifos)、甲基毒死蜱 (chlorpyrifos-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)、EPN、乙硫磷 (ethion)、灭线磷 (ethoprophos)、伐灭磷 (famphur)、苯线磷 (fenamiphos)、杀螟松 (fenitrothion)、倍硫磷 (fenthion)、噻唑磷 (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、异噁唑磷 (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)、氧乐果 (omethoate)、砒吸磷 (oxydemeton-methyl)、对硫磷 (parathion)、对硫磷甲酯 (parathion-methyl)、稻丰散 (phenthoate)、甲拌磷 (phorate)、伏杀硫磷 (phosalone)、亚胺硫磷 (phosmet)、磷胺 (phosphamidon)、胼硫磷 (phoxim)、甲基嘧啶磷 (pirimiphos-methyl)、丙溴磷 (profenofos)、胺丙畏 (propetamphos)、丙硫磷 (prothiofos)、吡唑硫磷 (pyraclofos)、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 (trichlorfon) 和蚜灭磷 (vamidothion)。

[0532] (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 (endosulfan); 或苯基吡唑类 (fiproles), 例如乙虫腈 (ethiprole) 和氟虫腈 (fipronil)。

[0533] (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)、丙烯除虫菊酯 (allethrin)、d-顺-反丙烯除虫菊酯、d-反丙烯除虫菊酯、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 (bioallethrin S-cyclopentenyl isomer)、生物苄呋菊酯 (bioresmethrin)、乙氰菊酯 (cycloprothrin)、氟氯氰菊酯 (cyfluthrin)、β-氟氯氰菊酯、氯氟氰菊酯 (cyhalothrin)、λ-氯氟氰菊酯、γ-氯氟氰菊酯、氯氰菊酯 (cypermethrin)、α-氯氰菊酯、β-氯氰菊酯、θ-氯氰菊酯、ζ-氯氰菊酯、苯醚氰菊酯 (cyphenothrin) [(1R)-反式异构体]、溴氰菊酯 (deltamethrin)、右旋烯炔菊酯 (empenthrin) [(EZ)-(1R) 异构体]、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)、苜蓿醚(halfenprox)、炔咪菊酯(imiprothrin)、噁恩菊酯(kadethrin)、momfluorothrin、苜蓿菊脂(permethrin)、苯醚菊酯(phenothrin) [(1R)-反式异构体]、炔丙菊酯(prallethrin)、除虫菊素(pyrethrins) (除虫菊(pyrethrum))、苜蓿菊酯(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(methoxychlor)。

[0534] (4) 烟碱乙酰胆碱受体(nAChR)激动剂,例如新烟碱(neonicotinoids),例如啉虫脒(acetamiprid)、噁虫胺(clothianidin)、呋虫胺(dinotefuran)、吡虫啉(imidacloprid)、烯啶虫胺(nitenpyram)、噁虫啉(thiacloprid)和噁虫嗪(thiamethoxam);或烟碱(nicotine);或氟啉虫胺腈(sulfoxaflor);或氟吡呋喃酮(flupyradifurone)。

[0535] (5) 烟碱乙酰胆碱受体(nAChR)变构激活剂,例如多杀菌素类(spinosyns),例如乙基多杀菌素(spinetoram)和多杀菌素(spinosad)。

[0536] (6) 氯离子通道激活剂,例如阿维菌素(avermectins)/米尔倍霉素类(milbemycins),例如阿巴克丁(abamectin)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐(emamectin benzoate)、雷皮菌素(lepimectin)和弥拜菌素(milbemectin)。

[0537] (7) 保幼激素模拟物,例如保幼激素类似物类,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)。

[0538] (8) 具有未知的或不明确的作用机理的活性化合物,例如

[0539] 卤代烷,例如溴甲烷和其他卤代烷;或氯化苦(chloropicrine);或硫酰氟(sulfuryl fluoride);或硼砂;或吐酒石。

[0540] (9) 选择性拒食剂,例如吡蚜酮(pymetrozine);或氟啉虫酰胺(flonicamid)。

[0541] (10) 螨生长抑制剂,例如四螨嗪(clofentezine)、噁螨酮(hexythiazox)和氟螨嗪(diflovidazin);或乙螨唑(etoxazole)。

[0542] (11) 昆虫肠膜微生物干扰剂,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*),以及BT植物蛋白:Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab1。

[0543] (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);或四氯杀螨砒(tetradifon)。

[0544] (13) 间断H⁺质子梯度的氧化磷酸化解偶联剂,例如虫螨腈(chlorfenapyr)、DNOC和氟虫胺(sulfluramid)。

[0545] (14) 烟碱乙酰胆碱受体拮抗剂,例如杀虫磺(bensultap)、杀螟丹盐酸盐(cartap hydrochloride)、杀虫环(thiocylam)和杀虫双(thiosultap-sodium)。

[0546] (15) 几丁质生物合成抑制剂,0型,例如双三氟虫脒(bistrifluron)、定虫隆(chlofluazuron)、除虫脒(diflubenzuron)、氟环脒(flucycloxuron)、氟虫脒(flufenoxuron)、氟铃脒(hexaflumuron)、虱螨脒(lufenuron)、双苯氟脒(novaluron)、多氟脒(noviflumuron)、伏虫隆(teflubenzuron)和杀铃脒(triflumuron)。

[0547] (16) 几丁质生物合成抑制剂,1型,例如噻嗪酮(buprofezin)。

[0548] (17) 蜕皮抑制剂(特别用于双翅目,即双翅类昆虫),例如灭蝇胺(cyromazine)。

[0549] (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)。

[0550] (19) 章鱼胺能激动剂,例如双甲脒(amitraz)。

[0551] (20) 复合物-III电子传递抑制剂,例如氟蚁腓(hydramethylnon);或灭螨醌(acequinocyl);或啞螨酯(flucacrypyrim)。

[0552] (21) 复合物-I电子传递抑制剂,例如METI杀螨剂,例如喹螨醚(fenazaquin)、啞螨酯(fenpyroximate)、啞螨醚(pyrimidifen)、啞螨灵(pyridaben)、吡螨胺(tebufenpyrad)和啞虫酰胺(tolfenpyrad);或鱼藤酮(rotenone)(鱼藤属(Derris))。

[0553] (22) 电压门控钠通道阻断剂,例如茚虫威(indoxacarb)或氰氟虫腓(metaflumizone)。

[0554] (23) 乙酰辅酶A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)。

[0555] (24) 复合物-IV电子传递抑制剂,例如膦类,例如磷化铝、磷化钙、膦和磷化锌;或氰化物。

[0556] (25) 复合物-II电子传递抑制剂,例如啞螨氰(cyenopyrafen)和丁氟螨酯(cyflumetofen)。

[0557] (28) 兰尼碱(ryanodine)受体效应物(effector),例如二酰胺,例如氯虫酰胺(chlorantraniliprole)、氰虫酰胺(cyantraniliprole)和氟虫酰胺(flubendiamide)。

[0558] 其他具有未知或不明确的作用机理的活性成分,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、环溴虫酰胺(cyclaniliprole)、环氧虫啉(cycloxaprid)、氯氟氰虫酰胺(cyhalodiamide)、dicloromezotiaz、三氯杀螨醇(dicofol)、氟螨啉(diflovidazin)、flometoquin、氟噻虫砒(fluensulfone)、啞虫胺(flufenerim)、氟菌螨酯(flufenoxystrobin)、丁烯氟虫腓(flufiprole)、fluhexafon、氟吡菌酰胺(flupyram)、fluralener、呋喃虫酰肼(fufenozide)、戊吡虫脒(guadipyr)、heptafluthrin、氯噻啉(imidaclothiz)、异菌脒(iprodione)、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、啞虫啉(paichongding)、pyflubumide、啞虫丙醚(pyridalyl)、pyrifluquinazon、啞螨胺(pyriminostrobin)、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)、氟氰虫酰胺(tetraniliprole)、氯虫苯甲酰胺(tetrachlorantraniliprole)、tioazafen、triflumezopyrim和碘甲烷;另外的基于坚强芽孢杆菌(Bacillus firmus)(I-1582,BioNeem,Votivo)的制剂,以及以下已知的活性化合物: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(由W02006/043635已知)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吡啶-

3,4'-吡啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮(由W02003/106457已知)、2-氯-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]吡啶-4-基}-4-(三氟甲基)苯基]异烟酰胺(由W02006/003494已知)、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(由W02009/049851已知)、3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基-乙基碳酸酯(由W02009/049851已知)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基吡啶-1-基)-5-氟嘧啶(由W02004/099160已知)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3-氯苯基)嘧啶(由W02003/076415已知)、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-甲基胍甲酸甲酯(由W02005/085216已知)、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-乙基胍甲酸甲酯(由W02005/085216已知)、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-甲基胍甲酸甲酯(由W02005/085216已知)、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-乙基胍甲酸甲酯(由W02005/085216已知)、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(由CN102057925已知)、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(由W02010/129500已知)、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(由W02009/080250已知)、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(由W02012/029672已知)、1-[(2-氯-1,3-噁唑-5-基)甲基]-4-氧-3-苯基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶-1-鎓-2-醇盐(由W02009/099929已知)、1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-4-氧-3-苯基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶-1-鎓-2-醇盐(由W02009/099929已知)、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(由CN101337940已知)、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(由W02008/134969已知)、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(由W02010018714已知)、[2-(2,4-二氯苯基)-3-氧-4-氧杂螺[4.5]癸-1-烯-1-基]碳酸丁酯(由CN 102060818已知)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4H-异噁唑-3-基]-N-[(Z)-甲氧基亚氨基甲基]-2-甲基苯甲酰胺(由W02007/026965已知)、3E)-3-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-亚吡啶基]-1,1,1-三氟丙-2-酮(由W02013/144213已知)、N-(甲基磺酰基)-6-[2-(吡啶-3-基)-1,3-噁唑-5-基]吡啶-2-羧酰胺(由W02012/000896已知)、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(由W02010/051926已知)。

[0559] 杀真菌剂

[0560] 本文中以其通用名称说明的活性成分是已知的,并且记载于例如“Pesticide Manual”或互联网(例如<http://www.alanwood.net/pesticides>)上。

[0561] 如果存在适当的官能团,则种类(1)至(15)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,如果互变异构是可能的,则种类(1)至(15)中列出的杀真菌混合组分也包括互变异构形式。

[0562] 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) 氧环唑 (azaconazole)、(1.03) 联苯三唑醇 (bitertanol)、(1.04) 糠菌唑 (bromuconazole)、(1.05) 环丙唑醇 (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) M-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 (fenhexamid)、(1.17) 苯锈啉 (fenpropidin)、(1.18) 丁苯吗啉 (fenpropimorph)、(1.19) 氟唑唑 (fluquinconazole)、(1.20) 呋咪醇 (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 (naftifin)、(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 (piperalin)、(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) 氟醚唑 (tetraconazole)、(1.50) 三唑酮 (triadimefon)、(1.51) 三唑醇 (triadimenol)、(1.52) 十三吗啉 (tridemorph)、(1.53) 氟菌唑 (triflumizole)、(1.54) 噻氮灵 (triforine)、(1.55) 灭菌唑 (triticonazole)、(1.56) 烯效唑 (uniconazole)、(1.57) 烯效唑-p (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-甲酸甲酯、(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、(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。

[0563] 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) 氟啶菌胺(diflumetorim)、(2.05) 甲呋酰胺(fenfuram)、(2.06) 氟吡菌酰胺(flupyram)、(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(反式差向异构对映异构体1R、4S、9S)、(2.14) 吡唑萘菌胺(反式差向异构对映异构体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(顺式差向异构对映异构体1R、4S、9R)、(2.17) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构对映异构体1S、4R、9S)、(2.18) 灭锈胺(mepconil)、(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-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。

[0564] 3) 作用于复合物III的呼吸链抑制剂,例如(3.01)唑啉菌胺(ametocetradin)、(3.02)吡唑磺菌胺(amisulbrom)、(3.03)唑啉菌酯(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(famoxadone)、(3.10)咪唑菌酮(fenamidon)、(3.11)氟菌螨酯(flufenoxystrobin)、(3.12)氟唑菌酯(fluxastrobin)、(3.13)醚菌酯(kresoxim-methyl)、(3.14)苯氧菌胺(metominostrobin)、(3.15)肟醚菌胺(orysastrobin)、(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-氟噻啉-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-(三氟甲基)苯基]乙氧基]亚氨基)甲基]苯基}乙酰胺、(3.27)烯肟菌胺(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,3-二甲基戊-3-烯酰胺。

[0565] 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)噁唑菌胺(ethaboxam)、(4.06)氟吡菌胺(fluopicolid)、(4.07)麦穗宁(fuberidazole)、(4.08)戊菌隆(pencycuron)、(4.09)噁苯咪唑(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。

[0566] 5) 能够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)苯氟磺胺(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)氟灭菌丹(fluorfolpet)、(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 (zinc metiram)、(5.27) 噻啉铜 (oxine-copper)、(5.28) 丙烷脒 (propamidine)、(5.29) 丙森锌 (propineb)、(5.30) 硫和硫制剂, 包括多硫化钙、(5.31) 福美双 (thiram)、(5.32) 对甲抑菌灵 (tolylfluanid)、(5.33) 代森锌 (zineb)、(5.34) 福美锌 (ziram)、(5.35) 敌菌灵 (anilazine)。

[0567] 6) 能够诱发宿主防御的化合物, 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)。

[0568] 7) 氨基酸和/或蛋白质生物合成抑制剂, 例如 (7.01) andoprim、(7.02) 杀稻瘟菌素-S (blasticidin-S)、(7.03) 噻菌环胺 (cyprodinil)、(7.04) 春雷霉素 (kasugamycin)、(7.05) 春雷霉素盐酸盐水合物 (kasugamycin 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-3,4-二氢异噻啉-1-基) 噻啉、(7.09) 氧四环素 (oxytetracycline)、(7.10) 链霉素 (streptomycin)。

[0569] 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)。

[0570] 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) 多抗霉素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。

[0571] 10) 脂质和膜合成抑制剂, 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 (etr Diazole)、(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) 硫菌威 (prothiocarb)、(10.12) 吡菌磷 (pyrazophos)、(10.13) 五氯硝基苯 (quintozene)、(10.14) 四氯硝基苯 (tecnazene)、(10.15) 甲基立枯磷 (tolclofos-methyl)。

[0572] 11) 黑色素生物合成抑制剂, 例如 (11.01) 环丙酰菌胺 (carpropamid)、(11.02) 双氯氰菌胺 (diclocymet)、(11.03) 氰菌胺 (fenoxanil)、(11.04) 四氯苯酞 (phthalide)、(11.05) 咯嗪酮 (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。

[0573] 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) 乙噻酚磺酸酯 (bupirimate)、(12.04) clozylacon、(12.05) 二甲噻酚 (dimethirimol)、(12.06) 乙噻酚 (ethirimol)、(12.07) 呋霜灵 (furalaxyl)、(12.08) 噁霉灵 (hymexazole)、(12.09) 甲霜灵 (metalaxyl)、(12.10) 高效霜

灵(metalaxyl-M)(精甲霜灵(mefenoxam))、(12.11)甲呋酰胺(ofurace)、(12.12)噁霜灵(oxadixyl)、(12.13)噁唑酸(oxolinic acid)、(12.14)辛噁酮(octhilinone)。

[0574] 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)喹氧灵(quinoxifen)、(13.07)乙烯菌核利(vinclozolin)、(13.08)丙氧喹啉(proquinazid)。

[0575] 14) 能够用作解偶联剂的化合物,例如(14.01)乐杀螨(binapacryl)、(14.02)消螨普(dinocap)、(14.03)噁菌腈(ferimzone)、(14.04)氟啶胺(fluzinam)、(14.05)消螨多(meptyldinocap)。

[0576] 15) 其他化合物,例如(15.001)苯噁硫氰(benthiazole)、(15.002)贝斯氧杂噻(bethoxazin)、(15.003)卡巴西霉素(capsimycin)、(15.004)香芹酮(carvone)、(15.005)灭螨猛(quinomethionate)、(15.006)甲氧苯啉菌(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)环丙磺酰胺(cyprosulfamide)、(15.011)棉隆(dazomet)、(15.012)咪菌威(debacarb)、(15.013)双氯酚(dichlorophen)、(15.014)哒菌清(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(flusulfamide)、(15.023)氟噁菌灵(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(methasulfocarb)、(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)奥施康定(oxyfenthiin)、(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-fosetylate)、(15.042)丙烷辛钠(propanosine-sodium)、(15.043)丁吡吗啉(pyrimorph)、(15.044)吡咯尼林(pyrrolnitrin)、(15.045)异丁乙氧喹啉(tebufloquin)、(15.046)叶枯酞(tecloftalam)、(15.047)甲磺菌胺(tolnifanid)、(15.048)咪唑啉(triazoxide)、(15.049)水杨菌胺(trichlamide)、(15.050)氰菌胺(zarilamid)、(15.051) (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-4,9-二氧代-1,5-二氧壬-7-基-2-甲基丙酸酯、(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-噁唑-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-噁唑-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) 1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁-2-基-1H-咪唑-1-甲酸酯、(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]噻啶-4(3H)-酮、(15.058) 2,6-二甲基-1H,5H-

[1,4]二噻英并[2,3-c:5,6-c']二吡咯-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-苯基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)乙酮、(15.060) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[(5S)-5-苯基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)乙酮、(15.061) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-{4-[4-(5-苯基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基)-1,3-噻唑-2-基]哌啶-1-基}乙酮、(15.062) 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-苯基苯酚和盐、(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-甲基哒嗪、(15.068) 4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基哒嗪、(15.069) 5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇、(15.070) 5-氯-N'-苯基-N'-(丙-2-炔-1-基)噻吩-2-磺酰肼、(15.071) 5-氟-2-[(4-氟苄基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.072) 5-氟-2-[(4-甲基苄基)氧基]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-甲酰胺、(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-甲酰胺、(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-甲酰胺、(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-甲酸、(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-茛-4-基) 苯甲酰胺、(15.102) 2-(6-苄基吡啶-2-基) 喹唑啉、(15.103) 2-[6-(3-氟-4-甲氧基苯基)-5-甲基吡啶-2-基] 喹唑啉、(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-茛-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-吡啶-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-吡啶-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-吡啶-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-吡啶-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-吡啶-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-吡啶-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-吡啶-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-吡啶-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-吡啶-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-吡啶-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-吡啶-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-吡啶-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-吡啶-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-吡啶-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-吡啶-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-吡啶-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-吡啶-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-吡啶-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-吡啶-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-吡啶-4-硫代甲酰胺、(15.132) N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基苯基)-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]-2,5-二甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.134) N-(4-氯-2,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡啶-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-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡啶-5-胺、(15.139) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡啶-5-胺、(15.140) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-

1H-吡唑-5-胺、(15.141) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.142) N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.143) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.144) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.145) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.146) N-(2-溴苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.147) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.148) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.149) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.150) N'-(4-{3-[(二氟甲基)硫基]苯氧基}-2,5-二甲基苯基)-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)硫基]苯氧基}苯基)-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)硫基]苯氧基}苯基)-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)硫基]苯氧基}苯基)-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)硫基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.155) N'-(4-{3-(二氟甲氧基)苯基}硫基)-2,5-二甲基苯基)-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)苯基}硫基)苯基)-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)苯基}硫基)苯基)-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)苯基}硫基)苯基)-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}硫基)苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(15.160) 2-[3,5-双(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-双(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-双(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-双(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-双(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-双(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-双(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-双(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-双(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-双(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-双(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-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噁唑-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-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噁唑-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-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噁唑-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-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噁唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基}-3-氯苯基甲烷磺酸酯。

[0577] 生物农药作为混合组分

[0578] 式(I)的化合物可与生物农药结合。

[0579] 生物农药特别地包括细菌、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。

[0580] 生物农药包括细菌,如形成孢子的细菌、根部定殖的细菌和起生物杀昆虫剂、杀真菌剂或杀线虫剂作用的细菌。

[0581] 用作或可用作生物农药的这类细菌的实例是:

[0582] 解淀粉芽孢杆菌(*Bacillus amyloliquefaciens*),菌株FZB42(DSM231179);或蜡状芽孢杆菌(*Bacillus cereus*),特别是蜡状芽孢杆菌菌株CNCM I-1562;或坚强芽孢杆菌菌株I-1582(登录号(Accession number)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(登记号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OST 30002(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),或苏云金芽孢杆菌鲑泽亚种,特别是菌株ABTS-1857(SD-1372),或苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种菌株HD-1,或苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种菌株NB 176(SD-5428);穿刺巴氏杆菌(*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)。

[0583] 用作或可用作生物农药的真菌和酵母的实例是:

[0584] 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;金龟子绿僵菌(*Metarhizium anisopliae*),特别是菌株F52(DSM3884/ATCC 90448);核果梅奇酵母菌(*Metschnikowia fructicola*),特别是菌株NRRL Y-30752;玫烟色拟青霉(*Paecilomyces fumosoroseus*) (新:*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);黄蓝状菌(*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(*Trichoderma harzianum*),

特别是哈茨木霉rifai T39(登录号CNCM I-952)。

[0585] 用作或可用作生物农药的病毒的实例是:

[0586] 棉褐带卷蛾(*Adoxophyes orana*) (夏季水果卷叶蛾(summer fruit tortrix)) 颗粒体病毒(GV)、苹果蠹蛾(*Cydia pomonella*(codling moth)) 颗粒体病毒(GV)、棉铃虫(*Helicoverpa armigera*(cotton bollworm)) 核型多角体病毒(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。

[0587] 还包括作为“接种菌”加入植物或植物部位或植物器官并借助其特殊的性质来促进植物生长和植物健康的细菌和真菌。实例包括:

[0588] 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.); 短根瘤菌属种(*Bradyrhizobium* spp.); 伯霍尔德杆菌属种(*Burkholderia* spp.), 特别是洋葱伯霍尔德杆菌(*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.), 特别是三叶草根瘤菌(*Rhizobium trifolii*); 须腹菌属种(*Rhizopogon* spp.); 硬皮马勃属种(*Scleroderma* spp.); 乳牛杆菌属种(*Suillus* spp.); 链霉菌属种(*Streptomyces* spp.)。

[0589] 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:

[0590] 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(chitin); Armour-Zen; 欧洲鳞毛蕨(*Dryopteris filix-mas*); 问荆(*Equisetum arvense*); Fortune Aza; Fungastop; Heads Up (奎奴亚藜皂苷(*Chenopodium quinoa* saponin) 提取物); 除虫菊/除虫菊素(pyrethrum/pyrethrins); 苦木(*Quassia amara*); 栎属(*Quercus*); 皂树(*Quillaja*); Regalia; “RequiemTM杀昆虫剂”; 鱼藤酮(rotenone); 鱼尼丁(ryania)/兰尼碱(ryanodine); 聚合草(*Symphytum officinale*); 菊蒿(*Tanacetum vulgare*); 百里香酚(thymol); Triact 70; 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, 特别是油菜粉或芥末粉。

[0591] 安全剂作为混合组分

[0592] 式(I)的化合物可与安全剂结合, 例如解草酮(benoxacor)、解毒唑(cloquintocet(-mexyl))、解草胺腈(cyometrinil)、环丙磺酰胺(cyprosulphamide)、烯丙酰草胺(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))、吡唑解草酸(mefenpyr(-diethyl))、萘二甲酸酐(naphthalic anhydride)、解草腈(oxabetrinil)、2-甲氧基-N-({4-[(甲基氨基酰基) 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)。

[0593] 植物和植物部位

[0594] 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,植物理解为意指所有的植物和植物种群,如需要的和不需要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、油菜以及水果植物(果实为苹果、梨、柑橘类水果和葡萄)。作物植物可为可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而获得的植物,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、插条和幼株(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(slips)和种子。

[0595] 本发明使用式(I)的化合物对植物和植物部位进行的处理直接进行或使所述化合物通过常规处理方法作用于其环境、生境或贮存空间来进行,所述常规处理方法为例如浸渍、喷雾、蒸发、弥雾(fogging)、散布(scattering)、涂抹、注射,并且在繁殖材料、特别是在种子的情况下,还可通过施用一层或多层包衣来进行。

[0596] 如上所提及,可以根据本发明处理所有植物及其部位。在一个优选的实施方案中,处理野生植物种和植物栽培种或通过常规生物育种方法(如杂交或原生质体融合)得到的那些及其部位。在另一个优选实施方案中,处理通过基因工程方法——如果合适,与常规方法相结合——获得的转基因植物和植物栽培种(基因修饰的有机体)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市售的常规植物栽培种的植物或使用中的植物。植物栽培种理解为意指具有新特性(“性状”)的并且通过常规育种、通过诱变或通过重组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。

[0597] 转基因植物、种子处理和整合株系(integration events)

[0598] 待根据本发明处理的优选的转基因植物或植物栽培种(通过遗传工程获得的那些)包括通过遗传修饰而接受了将特别有利的、有用的特性(“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、对高温或低温提高的耐受性、对干旱或对水或土壤盐度水平提高的耐受性、增强的开花性能、更容易采收、加速成熟、更高的采收产量、采收产物更高的质量和/或更高的营养价值、采收产物能够更长期地贮存和/或更好的加工性能。这些特性的其他且特别强调的实例是: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)在植物中形成的毒素而提高的植物对动物害虫和微生物害虫如昆虫、蛛形纲动物、线虫、螨、蛞蝓和蜗牛的抗性;以及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质和毒素引起的植物对植物病原性真菌、细菌和/或病毒提高的抗性;以及植物对某些除草活性成分(例如咪唑啉酮、磺酰脲、草甘膦或草丁膦)提高的耐受性(例如“PAT”基

因)。赋予所述期望特性(“性状”)的基因也可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,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、豌豆和其他种类的蔬菜、棉花、烟草、油菜以及水果植物(果实为苹果、梨、柑橘类水果和葡萄),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、线虫以及蛞蝓和蜗牛提高的抗性。

[0599] 作物保护——处理的类型

[0600] 使用式(I)的化合物对植物和植物部位直接进行处理,或通过作用于其环境、生境或储存空间来进行处理,所述处理采用常规处理方法,例如通过浸渍、喷雾、雾化、灌溉、蒸发、撒粉、弥雾、撒播、发泡、涂抹、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。此外,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)的化合物本身注入到土壤中。

[0601] 优选的对植物的直接处理是叶施用,即将式(I)的化合物施用至叶子,其中应当根据所讨论的害虫侵染水平来调整处理频率和施用率。

[0602] 在内吸收的活性成分的情况下,式(I)的化合物也可通过根系进入植物。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)引入至植物的位置。在水稻作物的情况下,这也可通过将固体施用形式(例如以颗粒剂的形式)的式(I)的化合物计量加入到淹没的(flooded)水稻田中来完成。

[0603] 种子处理

[0604] 通过处理植物的种子来防治动物害虫是早就已知的,并且是持续改进的主题。然而,种子处理牵涉一系列始终无法以令人满意的方式解决的问题。因此,期望开发用于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,处理种子的方法还应考虑抗虫或耐虫的转基因植物所固有的杀昆虫或杀线虫特性,以便使用最少的农药消耗实现对种子和发芽植物的最佳保护。

[0605] 因此,本发明还特别涉及通过用式(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。本发明的用于保护种子和发芽植物免受害虫侵袭的方法还包括这样的方法:其中在一次操作中同时地或依序用式(I)的化合物和混合组分处理种子。其还包括其中用式(I)的化合物和混合组分在不同时间处理种子的方法。

[0606] 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。

[0607] 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。本发明还涉及已用式(I)的化合物和混合组分同时处理的种子。本发明还涉及已用式(I)的化合物和混合组分在不同时间处理的种子。在已用式(I)的化合物和混合组分在不同时间处理的种子的情况下,各种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。

[0608] 本发明还涉及这样的种子：在用式(I)的化合物处理之后，对其进行薄膜包衣处理以防止灰尘对种子的磨损。

[0609] 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其后短时间内对作物立即进行处理。

[0610] 另一优点是，用式(I)的化合物处理种子可促进被处理种子的发芽和出苗。

[0611] 同样被认为有利的是，式(I)的化合物还尤其可用于转基因种子。

[0612] 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。

[0613] 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。更具体而言，包括谷物(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、芸苔(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)、水果植物、草坪和观赏植物的种子。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、芸苔、油菜和稻的种子。

[0614] 如上所提及，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微生物如芽孢杆菌属(Bacillus)、根瘤菌属(Rhizobium)、假单胞菌属(Pseudomonas)、沙雷氏菌属(Serratia)、木霉属(Trichoderma)、棒形杆菌属(Clavibacter)、球囊霉属(Glomus)或粘帚霉属(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。

[0615] 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伤。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、外壳、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，也可以使用在干燥后用例如水处理然后再干燥(例如涂底(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溶胀直至达到特定阶段(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。

[0616] 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。在以一定施用率下可表现出植物毒性作用的活性成分的情况下，必须特别确保这一点。

[0617] 通常，将式(I)的化合物以合适的制剂形式施用至种子。用于种子处理的合适的制剂和方法对于本领域技术人员是已知的。

[0618] 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、浆液或其他种子包衣组合物，以及ULV制剂。

[0619] 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的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、胶粘剂、赤霉素以及水。

[0620] 可以在根据本发明可用的拌种制剂中存在的染料是常规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。

[0621] 可以在根据本发明可用的拌种制剂中存在的有用的润湿剂是促进润湿且常规用于活性农用化学品成分的制剂的所有物质。可优选使用烷基萘磺酸盐, 如二异丙基萘磺酸盐或二异丁基萘磺酸盐。

[0622] 可以在根据本发明可用的拌种制剂中存在的合适的分散剂和/或乳化剂是常规用于活性农用化学品成分的制剂的所有非离子、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。

[0623] 可以在根据本发明可用的拌种制剂中存在的消泡剂是常规用于活性农用化学品成分的制剂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。

[0624] 可以在根据本发明可用的拌种制剂中存在的防腐剂是在农用化学品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。

[0625] 可以在根据本发明可用的拌种制剂中存在的二次增稠剂是在农用化学品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。

[0626] 可以在根据本发明可用的拌种制剂中存在的有用的粘着剂是可用于拌种产品中的所有常规粘合剂。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)。

[0627] 可以在根据本发明可用的拌种制剂中存在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。赤霉素是已知的(参见R. Wegler“Chemie der Pflanzenschutz-und **Schädlingsbekämpfungsmittel**”, 第2卷, Springer Verlag, 1970, 第401-412页)。

[0628] 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对以下种子进行拌种: 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也可用于转基因植物的拌种。

[0629] 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, 拌种的过程是: 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。

[0630] 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。

[0631] 动物健康

[0632] 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,尤其是昆虫和螨类。

[0633] 在兽医学领域,具有有利的恒温动物毒性的式(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。

[0634] 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、扁角鹿,以及特别是牛和猪;家禽,如火鸡、鸭、鹅,以及特别是鸡;例如在水产养殖中的鱼和甲壳类动物;以及昆虫,如蜜蜂。

[0635] 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,以及特别是狗、猫、笼鸟、爬行动物、两栖动物和观赏鱼。

[0636] 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。

[0637] 在另一个优选的实施方案中,将式(I)的化合物施用于鸟类,即笼鸟,以及特别是家禽。

[0638] 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。

[0639] 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受此类寄生虫感染的动物中的发病率降低至无害的程度。更具体而言,本文中的“防治”意指式(I)的化合物可杀死各寄生虫、抑制其生长或抑制其增殖。

[0640] 节肢动物包括:

[0641] 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.)、嚼虱属种(Trichodectes spp.)、猫羽虱属种(Felicola spp.);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.)、维蚋亚属种(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、蜂虻蝇属种(Braula spp.)、家蝇属种(Musca spp.)、齿股蝇属种(Hydrotaea spp.)、螫蝇属种(Stomoxys spp.)、角蝇属种(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.)、狂蝇属种(*Oestrus* spp.)、皮蝇属种(*Hypoderma* spp.)、胃蝇属种(*Gasterophilus* spp.)、虱蝇属种(*Hippobosca* spp.)、羊虱蝇属种(*Lipoptena* spp.)、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.)；

[0642] 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(*Blattarida*)的令人讨厌的害虫和卫生害虫。

[0643] 节肢动物还包括：

[0644] 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.)、残喙蜱属种(*Otobius* spp.)、硬蜱科(*Ixodidae*),如硬蜱属种(*Ixodes* spp.)、钝眼蜱属种(*Amblyomma* spp.)、扇头蜱属(牛蜱属)种(*Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp.)、革蜱属种(*Dermacentor* spp.)、血蜱属种(*Haemophysalis* spp.)、璃眼蜱属种(*Hyalomma* spp.)、扇头蜱属种(*Rhipicephalus* spp.) (多宿主蜱的原始属)；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.)、肺刺螨属种(*Pneumonyssus* spp.)、刺利螨属种(*Raillietia* spp.)、肺刺螨属种(*Pneumonyssus* spp.)、胸刺螨属种(*Sternostoma* spp.)、蜂螨属种(*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.)、Neotrombiculla属种、Listrophorus属种；以及粉螨目(*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.)、鸟疥螨属种(*Knemidocoptes* spp.)、胞螨属种(*Cytodites* spp.)、鸡雏螨属种(*Laminosioptes* spp.)。

[0645] 寄生性原生动物包括：

[0646] 鞭毛纲(*Mastigophora*) (鞭毛虫纲(*Flagellata*))，例如锥虫科(*Trypanosomatidae*)，如布氏锥虫(*Trypanosoma b. brucei*)、布氏冈比亚锥虫(*T. b. gambiense*)、布氏罗德西亚锥虫(*T. b. rhodesiense*)、刚果锥虫(*T. congolense*)、克氏锥虫(*T. cruzi*)、伊氏锥虫(*T. evansi*)、马锥虫(*T. equinum*)、路氏锥虫(*T. lewisi*)、鲟鱼锥虫(*T. percae*)、猿猴锥虫(*T. simiae*)、活跃锥虫(*T. vivax*)、巴西利什曼原虫(*Leishmania brasiliensis*)、杜氏利什曼原虫(*L. donovani*)、热带利什曼原虫(*L. tropica*)，例如毛滴虫科(*Trichomonadidae*)，如兰伯贾第虫(*Giardia lamblia*)、犬贾第虫(*G. canis*)；

[0647] 肉鞭虫门(*Sarcomastigophora*) (根足虫纲(*Rhizopoda*))，如内阿米巴科(*Entamoebidae*)，例如痢疾内阿米巴(*Entamoeba histolytica*)；哈氏科

(Hartmannellidae), 例如棘阿米巴属种 (*Acanthamoeba* sp.)、哈氏属种 (*Harmanella* sp.);

[0648] 顶复门 (Apicomplexa) (孢子虫纲 (Sporozoa)), 如艾美球虫科 (Eimeridae), 例如堆形艾美球虫 (*Eimeria acervulina*)、腺样艾美球虫 (*E.adenoides*)、阿拉巴马艾美球虫 (*E.alabamensis*)、鸭艾美球虫 (*E.anatis*)、鹅艾美球虫 (*E.anserina*)、阿氏艾美球虫 (*E.arloingi*)、阿沙塔艾美球虫 (*E.ashata*)、奥博伦艾美球虫 (*E.auburnensis*)、牛艾美球虫 (*E.bovis*)、布氏艾美球虫 (*E.brunetti*)、犬艾美球虫 (*E.canis*)、青紫蓝兔艾美球虫 (*E.chinchillae*)、鲱鱼艾美球虫 (*E.clupearum*)、鸽艾美球虫 (*E.columbae*)、弯曲艾美球虫 (*E.contorta*)、克兰多尔氏艾美球虫 (*E.crandalis*)、狄氏艾美球虫 (*E.debliecki*)、分散艾美球虫 (*E.dispersa*)、椭圆艾美球虫 (*E.ellipsoidales*)、镰刀形艾美球虫 (*E.falciformis*)、福氏艾美球虫 (*E.faurei*)、黄色艾美球虫 (*E.flavescens*)、加洛帕沃尼艾美球虫 (*E.gallopavonis*)、哈氏艾美球虫 (*E.hagani*)、肠艾美球虫 (*E.intestinalis*)、*E.iroquoina*、无残艾美球虫 (*E.irresidua*)、唇艾美球虫 (*E.labbeana*)、勒氏艾美球虫 (*E.leucarti*)、大型艾美球虫 (*E.magna*)、巨型艾美球虫 (*E.maxima*)、中型艾美球虫 (*E.media*)、珠鸡艾美球虫 (*E.meleagridis*)、珠鸡和缓米堤艾美球虫 (*E.meleagrimitis*)、和缓艾美球虫 (*E.mitis*)、毒害艾美球虫 (*E.necatrix*)、雅氏艾美球虫 (*E.ninakohlyakimovae*)、羊艾美球虫 (*E.ovis*)、小型艾美球虫 (*E.parva*)、孔雀艾美球虫 (*E.pavonis*)、穿孔艾美球虫 (*E.perforans*)、锥艾美球虫 (*E.phasani*)、梨形艾美球虫 (*E.piriformis*)、早熟艾美球虫 (*E.praecox*)、*E.residua*、粗糙艾美球虫 (*E.scabra*)、艾美球虫属种 (*E.spec.*)、斯氏艾美球虫 (*E.stiedai*)、猪艾美球虫 (*E.suis*)、禽艾美球虫 (*E.tenella*)、树艾美球虫 (*E.truncata*)、特鲁特艾美球虫 (*E.truttae*)、朱氏艾美球虫 (*E.zuernii*)、格洛虫属种 (*Globidium spec.*)、贝氏等孢子球虫 (*Isospora belli*)、犬等孢子球虫 (*I.canis*)、猫等孢子球虫 (*I.felis*)、俄亥俄等孢子球虫 (*I.ohioensis*)、芮氏等孢子球虫 (*I.rivolta*)、等孢子球虫属种 (*I.spec.*)、猪等孢子球虫 (*I.suis*)、囊等孢虫属种 (*Cystisopora spec.*)、隐孢子虫属种 (*Cryptosporidium spec.*) 特别是微小隐孢子虫 (*C.parvum*)；如弓形虫科 (*Toxoplasmodidae*)，例如鼠弓形虫 (*Toxoplasma gondii*)、*Hammondia heydornii*、犬新孢子虫 (*Neospora caninum*)、贝斯虫 (*Besnoitia besnoitii*)；如肉孢子虫科 (*Sarcocystidae*)，例如牛犬肉孢子虫 (*Sarcocystis bovis*)、牛人肉孢子虫 (*S.bovihominis*)、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.suihominis*)；如 *Leucozoidae*，例如 *Leucozytozoon simondi*；如疟原虫科 (*Plasmodiidae*)，例如伯氏疟原虫 (*Plasmodium berghei*)、恶性疟原虫 (*P.falciparum*)、三日疟原虫 (*P.malariae*)、卵形疟原虫 (*P.ovale*)、间日疟原虫 (*P.vivax*)，疟原虫属种 (*P.spec.*)；如梨质纲 (*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.*)、小泰勒虫 (*Theileria parva*)，泰勒虫属种 (*Theileria spec.*)；如匿虫亚目 (*Adeleina*)，例如犬肝簇虫 (*Hepatozoon canis*)、肝簇虫属种 (*H.spec.*)。

[0649] 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*)、棘头虫纲 (*Acanthocephala*) 和舌形虫属 (*Pentastoma*)。这些包括：

[0650] 单殖亚纲：例如：三代虫属种 (*Gyrodactylus spp.*)、指环虫属种 (*Dactylogyrus*

spp.)、多盘吸虫属种(*Polystoma* spp.)；

[0651] 绦虫类：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.)、复殖孔绦虫属种(*Diplogonoporus* spp.)；

[0652] 圆叶目(*Cyclophyllidea*)的绦虫，例如：中殖孔绦虫属种(*Mesocestoides* spp.)、裸头绦虫属种(*Anoplocephala* spp.)、副裸头绦虫属种(*Paranoplocephala* spp.)、蒙尼绦虫属种(*Moniezia* spp.)、缝体绦虫属种(*Thysanosomus* spp.)、曲子宫绦虫属种(*Thysaniezia* spp.)、无卵黄腺绦虫属种(*Avitellina* spp.)、斯泰勒绦虫属种(*Stilesia* spp.)、鸣绦虫属种(*Cittotaenia* spp.)、*Andrya*属种、伯特绦虫属种(*Bertiella* spp.)、带绦虫属种(*Taenia* spp.)、棘球绦虫属种(*Echinococcus* spp.)、泡尾绦虫属种(*Hydatigera* spp.)、代凡绦虫属种(*Davainea* spp.)、瑞利绦虫属种(*Raillietina* spp.)、膜壳绦虫属种(*Hymenolepis* spp.)、棘鳞绦虫属种(*Echinolepis* spp.)、棘叶绦虫属种(*Echinocotyle* spp.)、双睾绦虫属种(*Diorchis* spp.)、复孔绦虫属种(*Dipylidium* spp.)、约优克斯绦虫属种(*Joyeuxiella* spp.)、复孔绦虫属种(*Diplopylidium* spp.)；

[0653] 吸虫类：复殖纲(*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(*Austrotrichobilharzia* spp.)、巨毕吸虫属种(*Gigantobilharzia* spp.)、彩蚴吸虫属种(*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.)、低颈属种(*Hyporaeum* spp.)、片形吸虫属种(*Fasciola* spp.)、片形吸虫属种(*Fascioloides* spp.)、姜片吸虫属种(*Fasciolopsis* spp.)、环腔吸虫属种(*Cyclocoelum* spp.)、盲腔吸虫属种(*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(*Fischöderius* spp.)、腹袋吸虫属种(*Gastrothylacus* spp.)、背孔吸虫属种(*Notocotylus* spp.)、下弯吸虫属种(*Catantropis* 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.)、阔盘吸虫属种(*Eurytrema* spp.)、蛙吸虫属种(*Troglootrema* spp.)、并殖吸虫属种(*Paragonimus* spp.)、表孔吸虫属种(*Collyriclum* spp.)、侏形吸虫属种(*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.)；

[0654] 线虫类：毛形科(*Trichinellida*)，例如：鞭虫属种(*Trichuris* spp.)、毛细线虫属种(*Capillaria* spp.)、*Paracapillaria*属种、真鞘属种(*Eucolus* spp.)、*Trichomosoides*属种、毛线虫属种(*Trichinella* spp.)；

[0655] 垫刃目(*Tylenchida*)的线虫，例如：细丝线虫属种(*Micronema* spp.)、类圆线虫属种(*Strongyloides* spp.)；

[0656] 杆形目 (Rhabditina) 的线虫, 例如: 圆线虫属种 (*Strongylus* spp.)、三齿属种 (*Triodontophorus* spp.)、食道齿属种 (*Oesophagodontus* spp.)、毛线属种 (*Trichonema* spp.)、辐首线虫属种 (*Gyaloccephalus* spp.)、柱咽属种 (*Cylindropharynx* spp.)、杯口线虫属种 (*Poteriostomum* spp.)、*Cyclococercus* 属种、杯冠属种 (*Cylicostephanus* spp.)、结节线虫属种 (*Oesophagostomum* spp.)、夏柏特线虫属种 (*Chabertia* spp.)、冠尾线属种 (*Stephanurus* spp.)、钩口线虫属种 (*Ancylostoma* spp.)、钩虫属种 (*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.)、开口虫属种 (*Syngamus* spp.)、杯口属种 (*Cyathostoma* spp.)、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.)、新圆线虫属种 (*Neoststrongylus* spp.)、囊尾线虫属种 (*Cystocaulus* spp.)、肺圆属种 (*Pneumoststrongylus* spp.)、*Spicocaulus* 属种、鹿圆线虫属种 (*Elaphoststrongylus* spp.)、拟马鹿圆线虫属种 (*Parelaphoststrongylus* spp.)、环体线虫属种 (*Crenosoma* spp.)、*Paracrenosoma* 属种、奥斯勒线虫属种 (*Oslerus* spp.)、管圆线虫属种 (*Angiostrongylus* spp.)、猫圆线虫属种 (*Aelurostrongylus* spp.)、类丝虫属种 (*Filaroides* spp.)、副类丝虫属种 (*Parafilaroides* spp.)、毛圆线虫属种 (*Trichostrongylus* spp.)、血矛线虫属种 (*Haemonchus* spp.)、奥斯特线虫属种 (*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.)、沃鲁线虫属种 (*Ollulanus* spp.);

[0657] 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.)、贝利蛔虫属种 (*Baylisascaris* spp.)、副蛔虫属种 (*Parascaris* spp.)、异尖线虫属种 (*Anisakis* spp.)、鸡蛔虫属种 (*Ascaridia* spp.); 顎口线虫属种 (*Gnathostoma* spp.)、泡翼线虫属种 (*Physaloptera* spp.)、吸吮线虫属种 (*Thelazia* spp.)、筒线虫属种 (*Gongylonema* spp.)、丽线虫属种 (*Habronema* spp.)、副柔线属种 (*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.)、布鲁线虫属种 (*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.);

[0658] 棘头虫纲 (Acanthocephala): 寡棘吻目 (Oligacanthorhynchida), 例如: 巨吻棘头虫属种 (*Macracanthorhynchus* spp.)、前睾棘头虫属种 (*Prosthenorchis* spp.); 多形目 (Polymorphida), 例如: 细颈棘头虫属种 (*Filicollis* spp.); 念珠目 (Moniliformida), 例如: 念珠棘虫属种 (*Moniliformis* spp.);

[0659] 棘吻目 (Echinorhynchida), 例如棘头虫属种 (*Acanthocephalus* spp.)、钩头虫属

种 (*Echinorhynchus* spp.)、似细吻棘头虫属种 (*Leptorhynchoides* spp.)；

[0660] 舌形虫属 (*Pentastoma*)：蛇舌状虫目 (*Porocephalida*)，例如舌形虫属种 (*Linguatula* spp.)。

[0661] 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、胃肠外、真皮或鼻途径以合适制剂的形式施用。施用可为预防性或治疗性的。

[0662] 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。

[0663] 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) 的化合物适于例如在动物育种中、在动物饲养中、在动物笼舍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。

[0664] 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、在动物笼舍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。

[0665] 病媒的防治 (vector control)

[0666] 式 (I) 的化合物还可用于病媒的防治。在本发明的上下文中，病媒是能够将病原体 (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。病原体可机械地 (例如通过无刺苍蝇传播沙眼) 传播至宿主或可在注入后传播至宿主 (例如通过蚊子传播疟原虫)。

[0667] 病媒及其传播的疾病或病原体的实例是：

[0668] 1) 蚊子

[0669] -按蚊：疟疾、丝虫病；

[0670] -库蚊：日本脑炎、丝虫病、其他病毒性疾病、蠕虫的传播；

[0671] -伊蚊：黄热病、登革热、丝虫病、其他病毒性疾病；

[0672] -蚋科：蠕虫，特别是旋盘尾丝虫 (*Onchocerca volvulus*) 的传播；

[0673] 2) 虱：皮肤感染、流行性斑疹伤寒；

[0674] 3) 蚤：瘟疫、地方性斑疹伤寒；

[0675] 4) 蝇：昏睡病 (锥虫病)；霍乱、其他细菌性疾病；

[0676] 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)；

[0677] 6) 蜱：borreliosises，如杜通氏螺旋体 (*Borrelia duttoni*)、蜱媒脑炎、Q热 (贝氏柯克斯体 (*Coxiella burnetii*))、巴贝西虫病 (babesiosis) (犬巴贝斯虫 (*Babesia canis canis*))。

[0678] 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、苍蝇、叶蝉或蓟马。其他能够传播植物病毒病媒为蛛螨、虱、甲虫和线虫。

[0679] 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；跳蚤；

苍蝇、螨、和蜚。

[0680] 如果式(I)的化合物为抗性突破(resistance-breaking)的,则病媒的防治也是可能的。

[0681] 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。

[0682] 工业材料的保护

[0683] 式(I)的化合物适合用于保护工业材料免受昆虫的攻击或破坏,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。

[0684] 在本文中,工业材料理解为意指无生命材料,如优选塑料、胶粘剂、胶料、纸类和卡片、皮革、木材、加工木制品和涂料组合物。特别优选本发明用于保护木材的用途。

[0685] 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。

[0686] 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讨论的材料。合适的其他杀昆虫剂或杀真菌剂特别为上述的那些。

[0687] 令人惊讶地,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、码头和信号系统)免受污损。式(I)的化合物同样可单独地或与其它活性成分结合地用作防污剂。

[0688] 卫生领域中动物害虫的防治

[0689] 式(I)的化合物适合用于防治卫生领域中的动物害虫。更具体而言,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成分和/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。

[0690] 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。

[0691] 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;推进器驱动的蒸发器;无能量或无源的蒸发体系;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。

[0692] 方法和中间体的说明

[0693] 以下制备实施例和用途实施例说明本发明而非对其加以限制。产物通过¹H-NMR谱和/或LC/MS(液相色谱质谱联用)表征。

[0694] 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:

[0695] [a]酸性范围内的LC-MS测定用0.1%甲酸水溶液和乙腈(含有0.1%甲酸)作为洗脱剂在pH 2.7下进行;线性梯度为10%乙腈至95%乙腈。

[0696] [b]中性范围内的LC-MS测定用0.001摩尔的碳酸氢铵水溶液和乙腈作为洗脱剂在pH 7.8下进行;线性梯度为10%乙腈至95%乙腈。

[0697] 使用已知logP值(logP值基于保留时间通过两个连续烷酮之间的线性内插来确定)的非支化烷-2-酮(具有3至16个碳原子)进行校正。

[0698] NMR谱使用安装有流量探针头(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。

[0699] 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,然后列出圆括号内的信号强度。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。

[0700] 因此,一个实施例的峰列表具有以下形式:

[0701] δ₁(强度1);δ₂(强度2);……;δ_i(强度i);……;δ_n(强度n)

[0702] 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。

[0703] ¹H-NMR谱的化学位移的校正使用四甲基硅烷和/或溶剂的化学位移来实现,特别是在DMSO中测量的谱的情况下。因此,四甲基硅烷峰可以但并不必然在NMR峰列表中出现。

[0704] 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解释中列出的所有峰。

[0705] 此外,与常规¹H-NMR打印件一样,它们可以示出溶剂信号、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。

[0706] 在给出溶剂和/或水的δ范围内的化合物信号时,我们的¹H-NMR峰的列表显示出标准的溶剂峰,例如DMSO-D₆形式的DMSO的峰和水的峰,它们通常具有平均较高的强度。

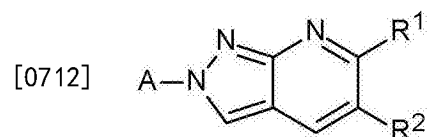
[0707] 目标化合物的立体异构体的峰和/或杂质的峰通常具有比目标化合物(例如,纯度>90%)的峰平均更低的强度。

[0708] 这类立体异构体和/或杂质对于特定的制备方法而言可能是典型的。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。

[0709] 如果需要的话,通过已知方法(MestreC,ACD模拟,以及凭经验估算的预期值)计算目标化合物的峰的专业人员可任选地使用其他强度滤波器来分离目标化合物的峰。这种分离与常规¹H-NMR解释中讨论的峰值拾取相似。

[0710] ¹H-NMR峰列表的其他细节可以见于Research Disclosure Database Number 564025。

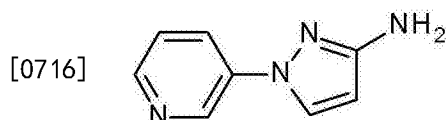
[0711] 式(I)的4,5-二取代的2-(杂芳基)-吡唑并[3,4-b]吡啶的一般合成



[0713] 实施例1:5-N-乙酰基氨基-2-(3-吡啶基)-吡唑并[3,4-b]吡啶(A=3-吡啶基;R¹=H,R²=NH-COCH₃)

[0714] 步骤1:

[0715] 1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-3-胺的合成



[0717] 在剧烈搅拌下,向260g (1.61mol) 3-溴吡啶和200g (2.40mol) 吡唑-3-胺的2.0升N,N-二甲基甲酰胺溶液中加入994g (7.2mol) 碳酸钾和137g (0.72mol) 碘化铜(I)。其后,将反应混合物在100℃下继续搅拌16小时。对于后处理,将反应混合物倒入水中,并滤出沉淀的固体。然后,将固体在二乙醚中洗涤并在减压下干燥。得到130g (收率:理论值的50.4%)的1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-3-胺。

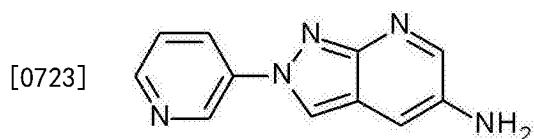
[0718] 步骤2:

[0719] 5-硝基-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶 (A=3-吡啶基; $R^1=H, R^2=NO_2$)

[0720] 向100g (0.662mol) 1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-3-胺和72.0g (0.662mol) 2-硝基丙烷二醇钠水合物(1:1:1)的2.0升N,N-二甲基甲酰胺溶液中加入550ml 三甲基氯硅烷,并将混合物在回流温度下加热12小时。反应结束后,将混合物冷却至室温,滤出固体并用300ml水洗涤。干燥后,获得76g (产率:理论值的50.2%)的5-硝基-2-(3-吡啶基)-吡唑并[3,4-b]吡啶,其为淡黄色固体。

[0721] 步骤3:

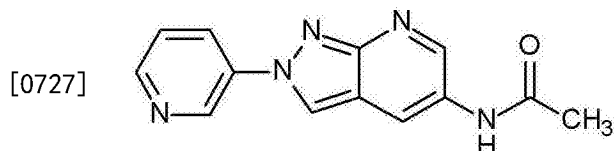
[0722] 5-氨基-2-(3-吡啶基)-吡唑并[3,4-b]吡啶 (A=3-吡啶基; $R^1=H, R^2=NH_2$)



[0724] 在0℃下,向70g (0.290mol) 5-硝基-2-(3-吡啶基)-吡唑并[3,4-b]吡啶于1.4升乙酸中的搅拌溶液中加入188.06g (2.9mol) 锌。搅拌混合物直至温度升至室温。反应结束后,将反应混合物倒入冰中。其后,加入乙酸乙酯,将形成的有机相移出并经硫酸钠干燥。将有机相在减压下浓缩后,获得51g粗产物,该粗产物在通过柱色谱法纯化后得到500mg (收率:理论值的5%) 5-氨基-2-(3-吡啶基)-吡唑并[3,4-b]吡啶,其为黄色固体。

[0725] 步骤4

[0726] 5-N-乙酰基氨基-2-(3-吡啶基)-吡唑并[3,4-b]吡啶 (A=3-吡啶基; $R^1=H, R^2=NH-COCH_3$)



[0728] 在0℃下,向0.20g (0.947mmol) 5-氨基-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶于约80ml吡啶中的初始进料中滴加1.20g (1.174mmol) 乙酸酐,然后将混合物在室温下搅拌约18小时。随后,将反应混合物在减压下浓缩,并将剩余的残留物通过柱色谱法(40g RP柱;梯度:乙腈/水;5%乙腈(5分钟)-45%乙腈(17分钟),然后在17分钟内至95%乙腈;流速:35ml/min)层析。得到99mg (99.4%纯度,收率:理论值的41%) 5-N-乙酰基氨基-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶。

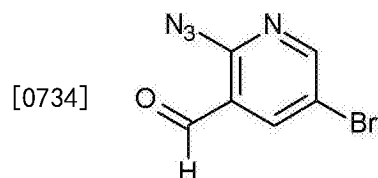
[0729] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 2.12$ (s, 3H, CH_3); 7.65–7.68; 8.46–8.49; 8.62–8.68 (4m, 5H, 杂芳基); 9.17 (s, 1H, 杂芳基); 9.31 (d, 1H; 杂芳基); 10.30 (s, 1H, NH) ppm.

[0730] LC-MS (m/z): 254.1 ($M+1$); $\text{C}_{13}\text{H}_{11}\text{N}_5\text{O}$ (253.25g/mol)

[0731] 实施例2: 5-[2-氟-4-甲基-5-(2,2,2-三氟乙基硫基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶

[0732] 步骤1:

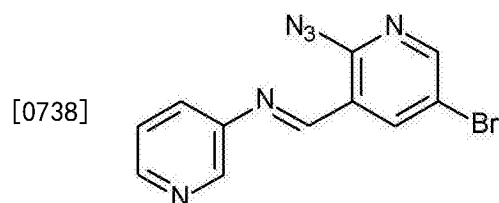
[0733] 2-叠氮基-5-溴吡啶-3-甲醛的合成



[0735] 向250ml圆底烧瓶中装入4.85g (23.77mmol) 5-溴-2-氟吡啶-3-甲醛、1.85g (28.46mmol) 叠氮化钠、880mg (2.38mmol) 四正丁基碘化铵和30ml二甲基亚砜。其后,将所得的反应混合物在室温下搅拌1小时。重复该过程四次。将所得溶液合并并且用600ml水稀释。将沉淀的固体滤出,并用100ml水洗涤三次。随后,将固体在减压下干燥。得到15.6g (收率:理论值的72%) 2-叠氮基-5-溴吡啶-3-甲醛,其为灰色固体。

[0736] 步骤2:

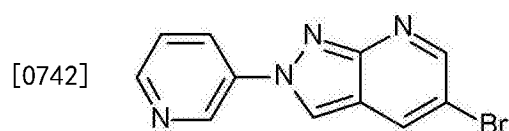
[0737] N-[(2-叠氮基-5-溴吡啶-3-基)亚甲基]吡啶-3-胺的合成



[0739] 在250ml圆底烧瓶中,对3.9g (17.18mmol) 2-叠氮基-5-溴吡啶-3-甲醛(实施例2,步骤1)、2.43g (25.82mmol) 吡啶-3-胺和78ml乙醇进行搅拌。其后,将反应溶液在油浴上在回流温度下加热6小时。重复该过程四次。将沉淀的固体滤出并用100ml石油醚洗涤三次。其后,将固体在减压下干燥。得到16.1g (收率:理论值的77%) 固体形式的N-[(2-叠氮基-5-溴吡啶-3-基)亚甲基]吡啶-3-胺。

[0740] 步骤3:

[0741] 5-溴-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶的合成



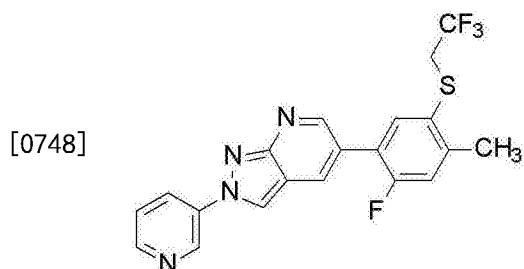
[0743] 在250ml圆底烧瓶中,将4g (13.20mmol) N-[(2-叠氮基-5-溴吡啶-3-基)亚甲基]吡啶-3-胺在80ml甲苯中搅拌。其后,将反应混合物在油浴上在回流温度下加热6小时。重复该过程四次。将沉淀的固体滤出并用100ml石油醚洗涤三次。其后,将固体在减压下干燥。得到12g (收率:理论值的82%) 棕色固体形式的5-溴-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶。

[0744] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, CDCl_3): $\delta = 9.25$ (d, $J = 2.4\text{Hz}$, 1H), 8.78 (d, $J = 2.4\text{Hz}$, 1H), 8.74 (dd, $J = 1.2\text{Hz}$, 4.8Hz, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.42 (m, 1H), 8.30 (d, $J = 2.4\text{Hz}$, 1H), 7.57 (dd, $J = 4.8\text{Hz}$, 8.4Hz, 1H) ppm.

[0745] LC-MS (ES, m/z) : 274.9, 276.9 [M+H]

[0746] 步骤4:

[0747] 5-[2-氟-4-甲基-5-(2,2,2-三氟乙基硫基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶

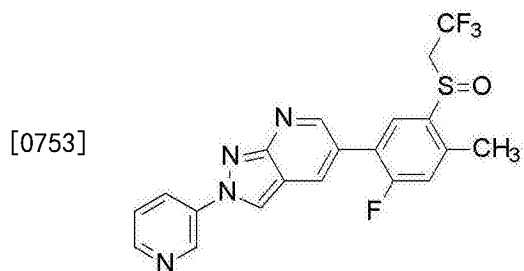


[0749] 向100mg (363 μ mol) 5-溴-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶 (实施例2, 步骤3) 和105mg (392 μ mol) [2-氟-4-甲基-5-(2,2,2-三氟乙基硫基)苯基]硼酸的混合物中加入77mg (0.73mmol) 碳酸钠于375 μ l水和1.5ml 1,4-二噁烷中的溶液。将反应混合物用氩气流反复吹扫, 加入15mg (19 μ mol) [1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁]二氯化钯(II) 并关闭容器。将混合物在CEM Discover微波反应器中加热至90 $^{\circ}$ C, 持续40分钟, 并在冷却至室温后通过用乙酸乙酯冲洗的深度过滤器过滤。在减压下除去溶剂后, 将残留物在硅胶上通过MPLC (梯度: 乙酸乙酯/环己烷0:100 $\rightarrow$ 100:0) 进行色谱分离。

[0750] 得到一个42mg (100%纯度, 收率: 27%) 的5-[2-氟-4-甲基-5-(2,2,2-三氟乙基硫基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶级分和另一个14mg (94%纯度, 收率为9%) 的5-[2-氟-4-甲基-5-(2,2,2-三氟乙基硫基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶级分。

[0751] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, d_6 -DMSO) : δ = 9.402 (3.4) ; 9.395 (3.4) ; 9.369 (9.7) ; 8.909 (2.2) ; 8.904 (4.1) ; 8.899 (2.3) ; 8.726 (2.3) ; 8.723 (2.6) ; 8.714 (2.5) ; 8.711 (2.6) ; 8.582 (1.3) ; 8.579 (1.6) ; 8.576 (1.5) ; 8.572 (1.4) ; 8.561 (1.5) ; 8.558 (1.5) ; 8.555 (1.7) ; 8.551 (1.4) ; 8.499 (2.7) ; 8.496 (3.2) ; 8.494 (3.1) ; 8.491 (2.7) ; 7.859 (3.1) ; 7.840 (3.1) ; 7.719 (1.9) ; 7.707 (1.8) ; 7.698 (1.8) ; 7.686 (1.7) ; 7.390 (2.7) ; 7.361 (2.6) ; 4.118 (1.3) ; 4.092 (4.1) ; 4.066 (4.2) ; 4.040 (1.5) ; 3.330 (28.9) ; 2.677 (0.4) ; 2.673 (0.5) ; 2.668 (0.4) ; 2.526 (1.5) ; 2.513 (29.3) ; 2.508 (59.9) ; 2.504 (79.1) ; 2.499 (58.1) ; 2.495 (28.8) ; 2.458 (16.0) ; 2.335 (0.4) ; 2.331 (0.5) ; 2.326 (0.4) ; 1.990 (0.5) ; 0.146 (0.6) ; 0.008 (4.6) ; 0.000 (127.8) ; -0.009 (5.3) ; -0.150 (0.6) ppm.

[0752] 实施例3: 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)吡唑并[3,4-b]吡啶

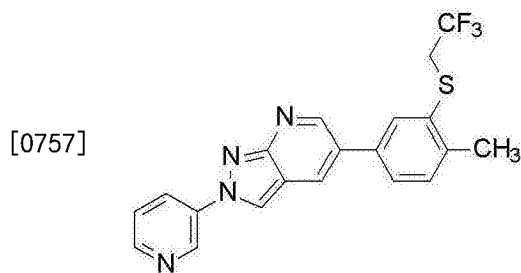


[0754] 在0 $^{\circ}$ C下, 将18mg (73 μ mol) 70%的间氯过氧苯甲酸加入到30mg (2 μ mol) 5-[2-氟-4-甲基-5-(2,2,2-三氟乙基硫基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶 (实施例2) 于

1.5ml二氯甲烷中的溶液中。将反应混合物在室温下搅拌2小时,然后加入饱和碳酸钠溶液。15分钟后,分离各相,将水相用二氯甲烷萃取,并将合并的有机相经硫酸钠干燥。在减压下除去溶剂,并将残留物在硅胶上通过MPLC(梯度:乙酸乙酯/环己烷0:100→100:0)进行色谱法分离。得到30mg(纯度为100%,收率:95%)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)吡唑并[3,4-b]吡啶。

[0755] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ =9.408 (3.5); 9.402 (3.5); 9.389 (9.4); 8.970 (2.2); 8.965 (4.0); 8.960 (2.3); 8.732 (2.4); 8.729 (2.6); 8.720 (2.5); 8.717 (2.6); 8.589 (4.5); 8.585 (4.7); 8.583 (4.2); 8.568 (1.5); 8.565 (1.6); 8.562 (1.7); 8.558 (1.4); 8.318 (0.4); 8.117 (3.2); 8.097 (3.2); 7.724 (1.8); 7.713 (1.8); 7.704 (1.8); 7.693 (1.7); 7.504 (2.5); 7.476 (2.5); 4.335 (0.7); 4.325 (0.5); 4.307 (0.8); 4.298 (1.4); 4.280 (0.4); 4.271 (1.7); 4.243 (1.7); 4.215 (1.5); 4.206 (0.8); 4.188 (0.6); 4.179 (0.7); 4.038 (0.4); 4.020 (0.4); 3.330 (87.7); 2.676 (0.7); 2.672 (0.9); 2.667 (0.7); 2.525 (2.7); 2.512 (54.7); 2.507 (109.0); 2.503 (142.0); 2.498 (103.8); 2.494 (51.5); 2.476 (16.0); 2.334 (0.7); 2.330 (0.9); 2.325 (0.7); 1.989 (1.6); 1.193 (0.4); 1.175 (0.9); 1.158 (0.4); 0.146 (0.7); 0.008 (5.8); 0.000 (150.5); -0.009 (5.9); -0.150 (0.7) ppm.

[0756] 实施例4:5-[4-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基硫基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶



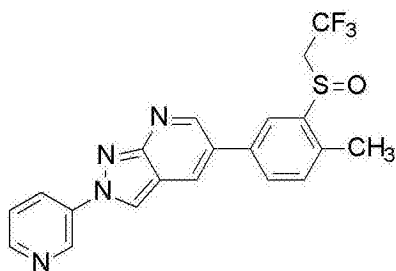
[0758] 5-[4-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基硫基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶的制备与5-[2-氟-4-甲基-5-(2,2,2-三氟乙基硫基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶的合成(参见实施例2)类似地进行。使用100mg (365 μmol) 5-溴-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶(实施例2,步骤3)和98mg (0.39mmol) [4-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基硫基)苯基]硼酸来进行。得到89mg(纯度为95%,收率:58%)的5-[4-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基硫基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶。

[0759] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ =9.409 (3.4); 9.403 (3.6); 9.342 (9.9); 9.330 (0.5); 9.106 (4.9); 9.100 (5.1); 8.719 (2.5); 8.715 (2.7); 8.707 (2.7); 8.703 (2.8); 8.586 (1.4); 8.583 (1.7); 8.579 (1.7); 8.576 (1.7); 8.570 (5.2); 8.565 (6.2); 8.559 (2.2); 8.555 (1.7); 7.925 (3.5); 7.921 (3.7); 7.714 (2.0); 7.702 (1.9); 7.693 (1.9); 7.682 (1.9); 7.680 (1.8); 7.657 (2.0); 7.652 (2.0); 7.637 (2.2); 7.632 (2.2); 7.416 (3.1); 7.396 (2.6); 4.228 (1.3); 4.202 (4.0); 4.176 (4.2); 4.150 (1.4); 3.333 (55.0); 2.678 (0.4); 2.673 (0.5); 2.669 (0.4); 2.526 (1.5); 2.521 (2.2); 2.513 (30.9); 2.508 (63.6); 2.504 (83.6); 2.499 (60.6); 2.495 (29.6); 2.420 (16.0); 2.369 (0.7); 2.335 (0.4); 2.331 (0.6); 2.326 (0.5); 1.990 (0.3); 0.008 (1.6); 0.000 (51.4); -0.009 (1.9) ppm.

[0760] 实施例5:5-[4-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基亚磺酰基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑并

[3,4-b]吡啶

[0761]

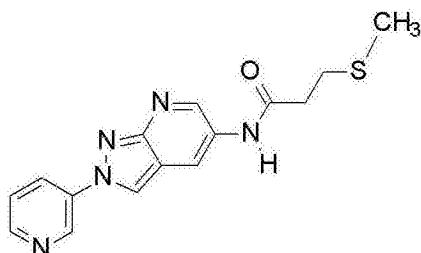


[0762] 5-[4-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基亚磺酰基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶的制备与5-[2-氟-4-甲基-5-(2,2,2-三氟乙基亚磺酰基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶的合成(实施例3)类似地进行。使用60mg (0.14mmol) 5-[4-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基亚磺酰基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶和36mg (0.14mmol) 间氯过氧苯甲酸(纯度70%)来进行。将粗产物与二氯甲烷混合并移出不溶性沉淀,然后干燥。以这种方式,获得13mg(纯度为89%,收率为19%) 5-[4-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基亚磺酰基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶。将滤液在减压下浓缩,并将残留物在硅胶上通过MPLC(梯度:乙酸乙酯/环己烷0:100→100:0)进行色谱法分离。以这种方式,获得两个另外的级分:22mg(纯度为99%,收率为37%)和5mg(纯度为91%,收率:8%)的5-[4-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基亚磺酰基)苯基]-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶。

[0763] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 9.413$ (3.6); 9.406 (3.7); 9.361 (9.9); 9.144 (5.0); 9.138 (5.1); 8.725 (2.6); 8.722 (2.8); 8.713 (2.7); 8.710 (2.8); 8.646 (5.1); 8.640 (5.0); 8.591 (1.5); 8.587 (1.7); 8.584 (1.6); 8.580 (1.5); 8.570 (1.6); 8.566 (1.7); 8.563 (1.8); 8.560 (1.5); 8.241 (4.0); 8.236 (4.2); 7.983 (2.0); 7.978 (1.9); 7.963 (2.2); 7.958 (2.2); 7.720 (2.0); 7.708 (1.9); 7.699 (2.0); 7.687 (1.9); 7.527 (3.0); 7.507 (2.7); 5.759 (0.4); 4.303 (0.6); 4.294 (0.5); 4.276 (0.8); 4.266 (1.6); 4.249 (0.7); 4.239 (1.6); 4.222 (1.5); 4.212 (0.8); 4.195 (1.7); 4.186 (0.8); 4.167 (0.6); 4.158 (0.7); 3.333 (27.3); 2.677 (0.3); 2.673 (0.4); 2.668 (0.3); 2.526 (1.0); 2.513 (24.1); 2.509 (49.3); 2.504 (64.7); 2.499 (47.5); 2.495 (23.7); 2.460 (16.0); 2.331 (0.4); 0.146 (0.5); 0.008 (4.0); 0.000 (98.7); -0.009 (4.5); -0.015 (0.7); -0.018 (0.7); -0.021 (0.6); -0.150 (0.4) ppm.

[0764] 实施例6: 3-甲基硫基-N-[2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基]丙酰胺

[0765]



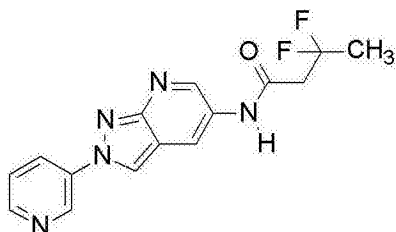
[0766] 在0℃下,向100mg (0.47mmol) 2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶-5-胺(实施例1,步骤3)于2.4ml乙腈和0.15ml吡啶中的悬浮液中加入0.06ml (0.5mmol) 3-甲硫基丙酰氯于2.4ml乙腈中的溶液。将反应混合物在室温下搅拌过夜。随后,向悬浮液中加入1ml吡啶,在室温下搅拌3小时,然后在0℃下再加入27.5 μl (238 μmol) 3-甲硫基丙酰氯。将反应混合物在室温下搅拌过夜,然后在0℃下加入另外13.8 μl (119 μmol) 3-甲硫基丙酰氯。在室温下再搅

拌3小时后,将反应混合物用水稀释并用乙酸乙酯反复萃取。将合并的有机相过滤。将移出的沉淀物干燥,并以此方式获得29mg (纯度为97%,收率为19%) 3-甲基硫基-N-[2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基]丙酰胺。将滤液在减压下浓缩。将残留物溶于乙酸乙酯中,并用饱和碳酸氢钠水溶液反复洗涤。然后将有机相用硫酸钠干燥,并在减压下除去溶剂。得到49mg (纯度为98%,收率:32%) 3-甲基硫基-N-[2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基]丙酰胺。

[0767] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 10.355 (2.1); 9.330 (2.1); 9.323 (2.1); 9.192 (5.3); 8.685 (1.5); 8.682 (1.5); 8.673 (1.7); 8.670 (2.0); 8.660 (5.0); 8.657 (4.8); 8.651 (1.1); 8.503 (0.8); 8.500 (0.9); 8.497 (0.9); 8.493 (0.8); 8.482 (0.9); 8.479 (1.0); 8.476 (1.0); 8.472 (0.8); 7.686 (1.1); 7.674 (1.1); 7.665 (1.1); 7.653 (1.1); 3.506 (0.3); 3.378 (3.0); 2.813 (1.0); 2.796 (2.9); 2.779 (2.2); 2.712 (2.1); 2.695 (2.7); 2.677 (1.3); 2.508 (50.0); 2.503 (63.8); 2.499 (46.2); 2.330 (0.4); 2.116 (16.0); 1.990 (0.4); 1.298 (0.4); 1.259 (0.6); 1.232 (0.7); 0.146 (0.4); 0.008 (3.3); 0.000 (81.7); -0.008 (3.3); -0.150 (0.4) ppm.

[0768] 实施例7: 3,3-二氟-N-[2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基]丁酰胺

[0769]

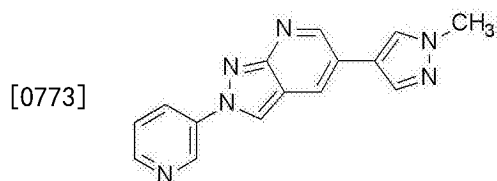


[0770] 在0℃下,向100mg (0.47mmol) 2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶-5-胺(实施例1,步骤3)于2.4ml乙腈和0.15ml吡啶中的悬浮液中加入67mg (0.47mmol) 3,3-二氟丁酰氯于2.4ml乙腈中的溶液。将反应混合物在室温下搅拌过夜。随后,在0℃下加入溶于1ml乙腈中的67mg (0.47mmol) 3,3-二氟丁酰氯的溶液。将反应混合物在室温下搅拌过夜,用水稀释并用乙酸乙酯反复萃取。将合并的有机相用硫酸钠干燥,并在减压下除去溶剂。将残留物在硅胶上通过MPLC(梯度:甲醇/二氯甲烷0:100→10:90)进行色谱法分离。随后,将所得粗产物溶于乙酸乙酯中,并用饱和碳酸氢钠水溶液反复洗涤。将有机相用硫酸钠干燥,并在减压下除去溶剂。得到57mg (纯度为94%,收率为36%) 3,3-二氟-N-[2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基]丁酰胺。将合并的含有碳酸氢钠水溶液的洗涤溶液用乙酸乙酯再萃取,得到第二个量的33mg (纯度为93%,收率:21%) 3,3-二氟-N-[2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基]丁酰胺。

[0771] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 10.530 (4.6); 9.332 (4.7); 9.326 (4.7); 9.202 (12.5); 9.192 (0.5); 8.690 (3.3); 8.686 (3.7); 8.678 (3.5); 8.675 (3.7); 8.659 (2.4); 8.651 (16.0); 8.507 (1.9); 8.503 (2.2); 8.500 (2.2); 8.497 (2.0); 8.486 (2.0); 8.482 (2.3); 8.479 (2.4); 8.476 (2.0); 8.314 (0.8); 7.686 (2.6); 7.674 (2.5); 7.665 (2.4); 7.655 (2.3); 7.653 (2.3); 3.320 (135.0); 3.171 (3.1); 3.133 (6.5); 3.096 (3.3); 2.676 (1.0); 2.671 (1.3); 2.667 (1.0); 2.524 (4.2); 2.511 (69.5); 2.507 (137.1); 2.502 (180.3); 2.498 (136.2); 2.493 (70.4); 2.333 (0.8); 2.329 (1.1); 2.325 (0.8); 1.861 (5.5); 1.813 (11.6); 1.765 (5.9); 1.234 (0.8); 0.146 (0.6); 0.008 (5.9); 0.000 (133.4); -0.009 (5.6); -0.150

(0.5) ppm.

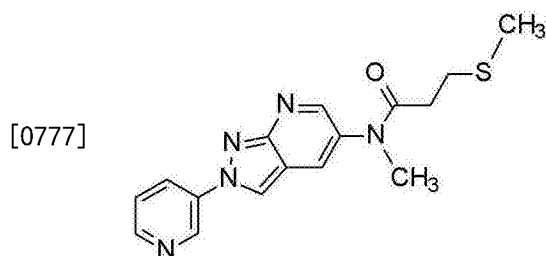
[0772] 实施例8:5-(1-甲基吡唑-4-基)-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶



[0774] 根据来自Ch.O.Ndubaku等, J. Med. Chem., 2013, 56, 4597-4610的反应方法, 将1.2ml水和0.6ml乙腈加入到100mg (365 μ mol) 5-溴-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶(实施例2, 步骤3)和107mg (1.09mmol) 乙酸钾的混合物中。将反应混合物用氩气流反复地吹扫, 然后加入114mg (547 μ mol) 1-甲基-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷-2-基)-1H-吡唑于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, 并将反应混合物在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甲醇冲洗过的深度过滤器过滤。反应总共进行两次, 并将两个批次合并, 然后进行纯化。将滤液在减压下浓缩, 并将残留物在硅胶上通过MPLC(梯度: 甲醇/二氯甲烷0:100 $\rightarrow$ 5:95)进行色谱法分离。随后, 将所得的粗产物用乙腈洗涤并干燥。得到78mg (纯度为98%, 收率为38%) 5-(1-甲基吡唑-4-基)-2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶。

[0775] $^1\text{H-NMR}$ (400.0MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ =9.376 (2.66); 9.370 (2.64); 9.226 (6.44); 9.030 (3.40); 9.024 (3.48); 8.696 (1.78); 8.693 (2.00); 8.684 (1.85); 8.681 (1.94); 8.549 (1.04); 8.545 (1.24); 8.542 (1.23); 8.539 (1.10); 8.528 (1.13); 8.524 (1.26); 8.521 (1.31); 8.518 (1.08); 8.378 (3.51); 8.372 (3.46); 8.329 (4.70); 8.053 (4.82); 7.693 (1.44); 7.681 (1.43); 7.672 (1.39); 7.661 (1.32); 3.905 (16.00); 3.320 (18.85); 2.672 (0.33); 2.507 (39.14); 2.503 (50.50); 2.499 (38.59); 2.330 (0.33); -0.000 (2.42) ppm.

[0776] 实施例10:N-[2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基]-N-甲基-3-甲基硫基丙酰胺



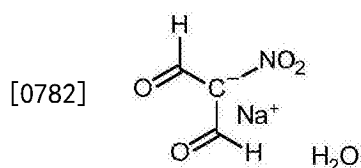
[0778] 在0 $^{\circ}$ C下, 向23mg (73 μ mol) 3-甲基硫基-N-[2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基]丙酰胺(实施例6)于无水N,N-二甲基甲酰胺中的溶液中加入4.4mg (0.11mmol) 氢化钠。15分钟后, 加入15.5mg (0.11mmol) 碘甲烷。将反应混合物在室温下搅拌过夜, 加入水, 然后将混合物用乙酸乙酯反复萃取。将合并的有机相用硫酸钠干燥并过滤, 并在减压下除去溶剂。将残留物在硅胶上通过MPLC(梯度: 乙酸乙酯/环己烷/甲醇0:100:0 $\rightarrow$ 100:0:0 $\rightarrow$ 0:0:100)进行色谱法分离。得到3.3mg (纯度为80%, 收率为11%) N-[2-(3-吡啶基)吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基]-N-甲基-3-甲基硫基丙酰胺。

[0779] $^1\text{H-NMR}$ (601.6MHz, CDCl_3): δ =9.238 (4.2); 9.234 (5.5); 8.744 (2.6); 8.738 (3.4); 8.646 (4.8); 8.642 (4.8); 8.635 (1.7); 8.631 (1.4); 8.562 (5.6); 8.546 (3.1); 8.405 (2.8);

8.403 (2.9) ; 8.401 (2.6) ; 8.392 (3.0) ; 8.390 (3.0) ; 8.387 (2.7) ; 7.990 (3.7) ; 7.987 (3.8) ; 7.928 (1.5) ; 7.924 (1.5) ; 7.569 (1.8) ; 7.566 (1.6) ; 7.561 (2.0) ; 7.557 (2.3) ; 7.548 (1.9) ; 7.433 (0.6) ; 7.262 (103.7) ; 7.085 (0.6) ; 6.462 (0.7) ; 6.460 (0.7) ; 6.435 (0.9) ; 6.432 (0.8) ; 5.614 (0.3) ; 3.453 (5.4) ; 3.375 (15.6) ; 2.802 (2.6) ; 2.790 (5.2) ; 2.778 (3.0) ; 2.573 (0.6) ; 2.429 (2.8) ; 2.417 (4.9) ; 2.405 (2.5) ; 2.008 (16.0) ; 1.568 (68.1) ; 1.427 (0.5) ; 1.423 (0.7) ; 1.336 (0.4) ; 1.333 (0.5) ; 1.284 (0.8) ; 1.277 (0.7) ; 1.254 (3.4) ; 0.892 (0.4) ; 0.880 (0.7) ; 0.868 (0.4) ; 0.844 (0.4) ; 0.097 (0.4) ; 0.069 (1.4) ; 0.005 (2.9) ; 0.000 (105.5) ; -0.006 (4.3) ; -0.100 (0.5) ppm.

[0780] 中间体的合成

[0781] 2-硝基丙烷二醇钠水合物 (1:1:1)



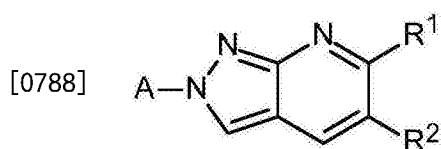
[0783] 在55℃的反应温度下,向55g (0.772mol) 亚硝酸钠于100ml乙醇中的搅拌溶液中逐步并分批加入50g (0.193mol) (2Z)-2,3-二溴-4-氧代-2-丁烯酸。其后,将反应混合物在55℃下再搅拌1小时。反应结束后,将混合物逐渐冷却至室温,然后冷却至10℃,在该过程中形成固体。将该固体滤出,用乙醇洗涤并自乙醇中再结晶。得到7.0g (收率:理论值的31%) 2-硝基丙烷二醇钠水合物 (1:1:1),其为棕色固体。

[0784] 根据本发明的制备方法的描述,还可制备例如下表1中所列的式(I)的化合物。

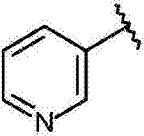
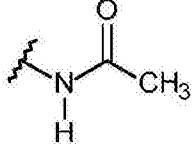
[0785] 式(I)的化合物以及可能未包括在式(I)中的那些化合物列于下表中。未包括在式(I)中的任何化合物也构成本发明主题的一部分。

[0786] 表1

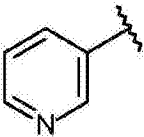
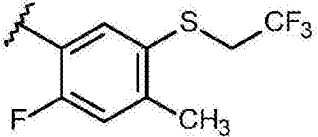
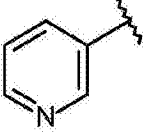
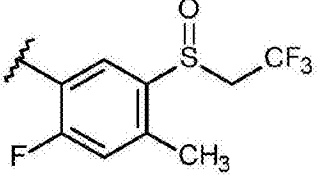
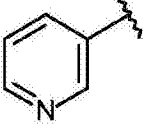
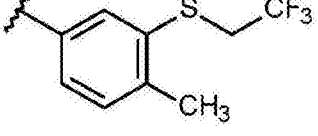
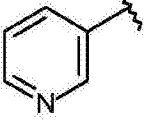
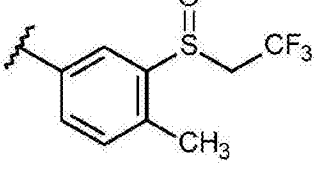
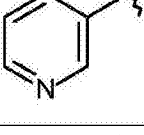
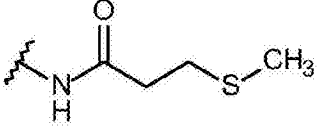
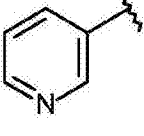
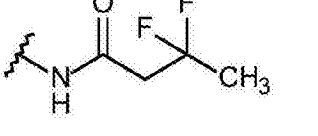
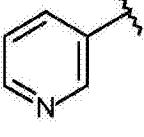
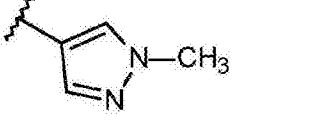
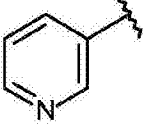
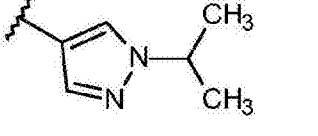
[0787] 下式的化合物



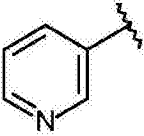
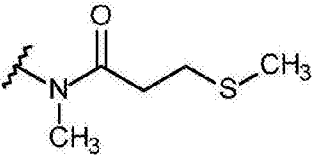
[0789]

化合物编号	A	R ¹	R ²
1		H	

[0790]

化合物编号	A	R ¹	R ²
2		H	
3		H	
4		H	
5		H	
6		H	
7		H	
8		H	
9		H	

[0791]

化合物编号	A	R ¹	R ²
10		H	

[0792] 表2

[0793] 所报道的化合物1-8的分析数据

[0794]

实施例编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
1		0.54	¹ H NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 2.12 (s, 3H, CH ₃); 7.65-7.68; 8.46-8.49; 8.62-8.68 (4m, 5H, 杂芳基); 9.17 (s, 1H, 杂芳基); 9.31 (d, 1H; 杂芳基); 10.30 (s, 1H, NH). LC-MS (m/z): 254.1 (M+1)
2	3.44	3.22	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.402 (3.4); 9.395 (3.4); 9.369 (9.7); 8.909 (2.2); 8.904 (4.1); 8.899 (2.3); 8.726 (2.3); 8.723 (2.6); 8.714 (2.5); 8.711 (2.6); 8.582 (1.3); 8.579 (1.6); 8.576 (1.5); 8.572 (1.4); 8.561 (1.5); 8.558 (1.5); 8.555 (1.7); 8.551 (1.4); 8.499 (2.7); 8.496 (3.2); 8.494 (3.1); 8.491 (2.7); 7.859 (3.1); 7.840 (3.1); 7.719 (1.9); 7.707 (1.8); 7.698 (1.8); 7.686 (1.7); 7.390 (2.7); 7.361 (2.6); 4.118 (1.3); 4.092 (4.1); 4.066 (4.2); 4.040 (1.5); 3.330 (28.9); 2.677 (0.4); 2.673 (0.5); 2.668 (0.4); 2.526 (1.5); 2.513 (29.3); 2.508 (59.9); 2.504 (79.1); 2.499 (58.1); 2.495 (28.8); 2.458 (16.0); 2.335 (0.4); 2.331 (0.5); 2.326 (0.4); 1.990 (0.5); 0.146 (0.6); 0.008 (4.6); 0.000 (127.8); -0.009 (5.3); -0.150 (0.6).
3	2.14	2.11	¹ H NMR(400.0 MHz, d ₆ DMSO): δ= 9.408 (3.5); 9.402 (3.5); 9.389 (9.4); 8.970 (2.2); 8.965 (4.0); 8.960 (2.3); 8.732 (2.4); 8.729 (2.6); 8.720 (2.5); 8.717 (2.6); 8.589 (4.5);

[0795]

实施例 编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
			8.585 (4.7); 8.583 (4.2); 8.568 (1.5); 8.565 (1.6); 8.562 (1.7); 8.558 (1.4); 8.318 (0.4); 8.117 (3.2); 8.097 (3.2); 7.724 (1.8); 7.713 (1.8); 7.704 (1.8); 7.693 (1.7); 7.504 (2.5); 7.476 (2.5); 4.335 (0.7); 4.325 (0.5); 4.307 (0.8); 4.298 (1.4); 4.280 (0.4); 4.271 (1.7); 4.243 (1.7); 4.215 (1.5); 4.206 (0.8); 4.188 (0.6); 4.179 (0.7); 4.038 (0.4); 4.020 (0.4); 3.330 (87.7); 2.676 (0.7); 2.672 (0.9); 2.667 (0.7); 2.525 (2.7); 2.512 (54.7); 2.507 (109.0); 2.503 (142.0); 2.498 (103.8); 2.494 (51.5); 2.476 (16.0); 2.334 (0.7); 2.330 (0.9); 2.325 (0.7); 1.989 (1.6); 1.193 (0.4); 1.175 (0.9); 1.158 (0.4); 0.146 (0.7); 0.008 (5.8); 0.000 (150.5); -0.009 (5.9); -0.150 (0.7).
4	3.14	3.10	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.409(3.4); 9.403(3.6); 9.342(9.9); 9.330(0.5); 9.106(4.9); 9.100(5.1); 8.719(2.5); 8.715(2.7); 8.707(2.7); 8.703(2.8); 8.586(1.4); 8.583(1.7); 8.579(1.7); 8.576(1.7); 8.570(5.2); 8.565(6.2); 8.559(2.2); 8.555(1.7); 7.925(3.5); 7.921(3.7); 7.714(2.0); 7.702(1.9); 7.693(1.9); 7.682(1.9); 7.680(1.8); 7.657(2.0); 7.652(2.0); 7.637(2.2); 7.632(2.2); 7.416(3.1); 7.396(2.6); 4.228(1.3); 4.202(4.0); 4.176(4.2); 4.150(1.4); 3.333(55.0); 2.678(0.4); 2.673(0.5); 2.669(0.4); 2.526(1.5); 2.521(2.2); 2.513(30.9); 2.508(63.6); 2.504(83.6); 2.499(60.6); 2.495(29.6); 2.420(16.0); 2.369(0.7); 2.335(0.4); 2.331(0.6); 2.326(0.5); 1.990(0.3); 0.008(1.6); 0.000(51.4); -0.009(1.9).
5	2.07	2.03	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.413(3.6); 9.406(3.7); 9.361(9.9); 9.144(5.0); 9.138(5.1); 8.725(2.6);

[0796]

实施例 编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
			8.722(2.8); 8.713(2.7); 8.710(2.8); 8.646(5.1); 8.640(5.0); 8.591(1.5); 8.587(1.7); 8.584(1.6); 8.580(1.5); 8.570(1.6); 8.566(1.7); 8.563(1.8); 8.560(1.5); 8.241(4.0); 8.236(4.2); 7.983(2.0); 7.978(1.9); 7.963(2.2); 7.958(2.2); 7.720(2.0); 7.708(1.9); 7.699(2.0); 7.687(1.9); 7.527(3.0); 7.507(2.7); 5.759(0.4); 4.303(0.6); 4.294(0.5); 4.276(0.8); 4.266(1.6); 4.249(0.7); 4.239(1.6); 4.222(1.5); 4.212(0.8); 4.195(1.7); 4.186(0.8); 4.167(0.6); 4.158(0.7); 3.333(27.3); 2.677(0.3); 2.673(0.4); 2.668(0.3); 2.526(1.0); 2.513(24.1); 2.509(49.3); 2.504(64.7); 2.499(47.5); 2.495(23.7); 2.460(16.0); 2.331(0.4); 0.146(0.5); 0.008(4.0); 0.000(98.7); -0.009(4.5); -0.015(0.7); -0.018(0.7); -0.021(0.6); -0.150(0.4).
6	1.15	1.21	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10.355(2.1); 9.330(2.1); 9.323(2.1); 9.192(5.3); 8.685(1.5); 8.682(1.5); 8.673(1.7); 8.670(2.0); 8.660(5.0); 8.657(4.8); 8.651(1.1); 8.503(0.8); 8.500(0.9); 8.497(0.9); 8.493(0.8); 8.482(0.9); 8.479(1.0); 8.476(1.0); 8.472(0.8); 7.686(1.1); 7.674(1.1); 7.665(1.1); 7.653(1.1); 3.506(0.3); 3.378(3.0); 2.813(1.0); 2.796(2.9); 2.779(2.2); 2.712(2.1); 2.695(2.7); 2.677(1.3); 2.508(50.0); 2.503(63.8); 2.499(46.2); 2.330(0.4); 2.116(16.0); 1.990(0.4); 1.298(0.4); 1.259(0.6); 1.232(0.7); 0.146(0.4); 0.008(3.3); 0.000(81.7); -0.008(3.3); -0.150(0.4).
7	1.22	1.22	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10.530(4.6); 9.332(4.7); 9.326(4.7);

[0797]

实施例 编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
			9.202(12.5); 9.192(0.5); 8.690(3.3); 8.686(3.7); 8.678(3.5); 8.675(3.7); 8.659(2.4); 8.651(16.0); 8.507(1.9); 8.503(2.2); 8.500(2.2); 8.497(2.0); 8.486(2.0); 8.482(2.3); 8.479(2.4); 8.476(2.0); 8.314(0.8); 7.686(2.6); 7.674(2.5); 7.665(2.4); 7.655(2.3); 7.653(2.3); 3.320(135.0); 3.171(3.1); 3.133(6.5); 3.096(3.3); 2.676(1.0); 2.671(1.3); 2.667(1.0); 2.524(4.2); 2.511(69.5); 2.507(137.1); 2.502(180.3); 2.498(136.2); 2.493(70.4); 2.333(0.8); 2.329(1.1); 2.325(0.8); 1.861(5.5); 1.813(11.6); 1.765(5.9); 1.234(0.8); 0.146(0.6); 0.008(5.9); 0.000(133.4); -0.009(5.6); -0.150(0.5).
8	1.00	1.15	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.376(2.66); 9.370(2.64); 9.226(6.44); 9.030(3.40); 9.024(3.48); 8.696(1.78); 8.693(2.00); 8.684(1.85); 8.681(1.94); 8.549(1.04); 8.545(1.24); 8.542(1.23); 8.539(1.10); 8.528(1.13); 8.524(1.26); 8.521(1.31); 8.518(1.08); 8.378(3.51); 8.372(3.46); 8.329(4.70); 8.053(4.82); 7.693(1.44); 7.681(1.43); 7.672(1.39); 7.661(1.32); 3.905(16.00); 3.320(18.85); 2.672(0.33); 2.507(39.14); 2.503(50.50); 2.499(38.59); 2.330(0.33); -0.000 (2.42).
9	1.54	1.53	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.379(2.3);9.372(2.4);9.223(6.0);9.061(3.1); 9.055(3.2);8.696(1.6);8.693(1.7);8.684(1.7); 8.681(1.7);8.550(0.9);8.547(1.1);8.544(1.1); 8.540(1.0);8.529(1.0);8.526(1.1);8.523(1.2); 8.519(1.0);8.441(4.3);8.395(3.2);8.390(3.2); 8.060(4.4);7.694(1.3);7.682(1.3);7.673(1.3); 7.661(1.2);4.571(0.4);4.554(1.1);4.537(1.5); 4.521(1.1);4.504(0.4);3.321(35.5);2.672(0.3); 2.507(36.2);2.503(47.6);2.498(36.1);1.989(

[0798]

实施例 编号	logP[a]	logP[b]	¹ H-NMR [δ (ppm)]或 LC-MS [m/z]
			0.4);1.489(16.0);1.472(15.9);0.008(2.0);0.000(47.9);-0.008(2.8)
10	1.16	1.20	¹ H-NMR(601.6 MHz, CDCl ₃): δ = 9.238(4.2);9.234(5.5);8.744(2.6);8.738(3.4);8.646(4.8);8.642(4.8);8.635(1.7);8.631(1.4);8.562(5.6);8.546(3.1);8.405(2.8);8.403(2.9);8.401(2.6);8.392(3.0);8.390(3.0);8.387(2.7);7.990(3.7);7.987(3.8);7.928(1.5);7.924(1.5);7.569(1.8);7.566(1.6);7.561(2.0);7.557(2.3);7.548(1.9);7.433(0.6);7.262(103.7);7.085(0.6);6.462(0.7);6.460(0.7);6.435(0.9);6.432(0.8);5.614(0.3);3.453(5.4);3.375(15.6);2.802(2.6);2.790(5.2);2.778(3.0);2.573(0.6);2.429(2.8);2.417(4.9);2.405(2.5);2.008(16.0);1.568(68.1);1.427(0.5);1.423(0.7);1.336(0.4);1.333(0.5);1.284(0.8);1.277(0.7);1.254(3.4);0.892(0.4);0.880(0.7);0.868(0.4);0.844(0.4);0.097(0.4);0.069(1.4);0.005(2.9);0.000(105.5);-0.006(4.3);-0.100(0.5)

[0799] 生物实施例

[0800] 桃蚜 (*Myzus persicae*) -喷雾试验

[0801] 溶剂:78重量份的丙酮

[0802] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0803] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0804] 为制备合适的活性成分制剂,将1重量份的活性成分用特定重量份的溶剂溶解,并用含有浓度为1000ppm的乳化剂的水补充直至达到所需浓度。为制备其他试验浓度,将该制剂用含有乳化剂的水稀释。

[0805] 向被所有阶段的桃蚜侵染的大白菜 (*Brassica pekinensis*) 的叶片喷洒所需浓度的活性成分制剂。

[0806] 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。

[0807] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在500g/ha的施用率下显示出100%的功效:4、5、6

[0808] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在500g/ha的施用率下显示出90%的功效:2、3、7、8、9、10

[0809] 棉蚜 (*Aphis gossypii*) -喷雾试验

[0810] 溶剂:7重量份的二甲基甲酰胺

[0811] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0812] 为制备合适的活性成分制剂,将1重量份的活性成分用特定重量份的溶剂溶解,并用含有浓度为1000ppm的乳化剂的水补充直至达到所需浓度。为制备其他试验浓度,将该制剂用含有乳化剂的水稀释。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。

[0813] 用所需浓度的活性成分制剂对被棉蚜严重侵染的棉株 (*Gossypium hirsutum*) 进行喷洒。

[0814] 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。

[0815] 在该试验中,例如,以下制备实施例的化合物在4ppm的施用率下显示出95%的功
效:1