



(12)发明专利申请

(10)申请公布号 CN 109071507 A

(43)申请公布日 2018.12.21

(21)申请号 201780022855.6

S·艾尔马斯 P·劳赛尔

(22)申请日 2017.02.06

W·安德施 U·戈根斯

(30)优先权数据

(74)专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司 11285

16155136.1 2016.02.11 EP

代理人 田华 钟守期

(85)PCT国际申请进入国家阶段日

2018.10.10

(51)Int.Cl.

(86)PCT国际申请的申请数据

G07D 403/14(2006.01)

PCT/EP2017/052497 2017.02.06

A01N 37/22(2006.01)

(87)PCT国际申请的公布数据

W02017/137337 DE 2017.08.17

(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 M·海尔 R·费舍尔 J-R·詹森

D·维尔基 M·维洛特

S·库贝勒 K·伊尔格

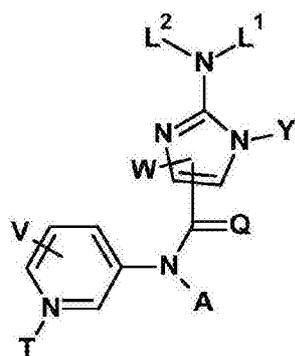
权利要求书7页 说明书72页

(54)发明名称

作为害虫防治剂的取代的咪唑基羧酰胺

(57)摘要

本发明涉及通式(I)的化合物

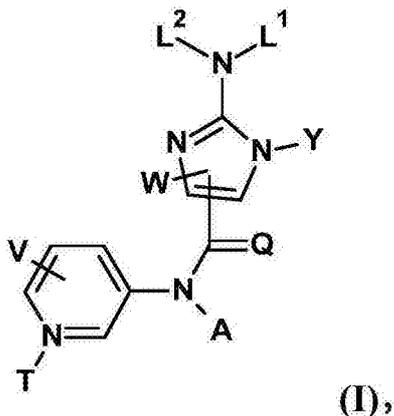


其中Q、V、T、W、Y、

(I),

L¹、L²和A具有说明书中给出的含义,以及涉及所述化合物用于防治动物害虫的用途。

1. 式 (I) 的化合物及其盐



其中

Q代表氧或硫,

V代表选自以下的基团:氢、卤素、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基和氰基,

W代表选自以下的基团:氢、卤素、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基和氰基,

Y代表选自以下的基团:氢, 氰基, 任选取代的烷基、烯基或炔基, 任选被杂原子间隔的任选取代的环烷基, 任选被杂原子间隔的任选取代的环烷基烷基, 芳烷基或杂芳基烷基,

A代表选自以下的基团:氢, 任选取代的烷基、烯基或炔基以及任选被杂原子间隔的任选取代的环烷基或环烷基烷基,

T代表氧或电子对,

L¹代表选自以下的基团:氢, 任选取代的烷基、烯基、炔基, 或环烷基, 以及代表基团C(O)R²、C(O)N(R³)(R⁴)、C(O)OR⁵和SO₂R⁶,

L²代表选自以下的基团:氢, N(R^{3a})(R^{4a}), 任选取代的烷基、烯基、炔基或烷氧基, 任选被杂原子间隔的任选取代的环烷基或环烷基烷基, 以及任选取代的芳基、芳烷基、杂芳基或杂芳基烷基,

或

L¹和L²与同它们所连接的氮原子一起代表具有3至7个环原子的任选取代的饱和杂环、部分饱和杂环或芳族杂环, 其可任选被其他杂原子和/或被一个或两个C=O基团间隔,

R²代表选自以下的基团:氢, 任选取代的烷基、烯基或炔基, 任选取代的环烷基, 任选取代的芳基或杂芳基以及任选取代的芳烷基或杂芳基烷基,

R³和R⁴彼此独立地代表选自以下的基团:氢, 任选取代的烷基、烯基或炔基, 任选取代的饱和或不饱和的环烷基、环烷基烷基、芳基、杂芳基、芳烷基或杂芳基烷基,

或

R³和R⁴一起形成任选取代的3-元至7-元脂族环, 其任选含有氮原子、硫原子或氧原子,

R^{3a}代表选自以下的基团:氢, 任选取代的烷基, 任选取代的环烷基、芳基、杂芳基、芳烷基或杂芳基烷基,

R^{4a}代表选自以下的基团:氢, 任选取代的烷基、任选取代的C₃-C₆-环烷基以及代表基团C(O)R²、C(O)OR⁵和SO₂R⁶,

R⁵代表任选取代的烷基、烯基或炔基, 任选取代的环烷基或环烷基烷基,

R⁶代表选自以下的基团:任选取代的烷基、烯基或炔基, 任选取代的环烷基、环烷基烷

基、芳基、芳烷基、杂芳基或杂芳基烷基。

2. 根据权利要求1所述的化合物及其盐, 其中

Q代表氧或硫,

V代表选自以下的基团: 氢、卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基和氰基,

W代表选自以下的基团: 氢、卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基和氰基,

Y代表选自以下的基团: 氢; C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-烯基或C₃-C₆-炔基, 其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-或氰基单取代至多取代; C₃-C₈-环烷基, 其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或氰基单取代至二取代; 直链或支链C₃-C₈-环烷基-C₁-C₄-烷基, 其任选彼此独立地被O、S(O)_n、CO或NR^{4a}间隔一次或两次, 以及任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或氰基单取代至四取代; 芳基-C₁-C₄-烷基或杂芳基-C₁-C₄-烷基, 其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基-S(O)_n-、硝基或氰基单取代至三取代,

A代表选自以下的基团: 氢; C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-烯基或C₃-C₆-炔基, 其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-或氰基单取代至多取代; 以及C₃-C₆-环烷基, 其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或氰基单取代或二取代; 以及C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-烯基或C₃-C₆-炔基, 其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-或氰基单取代至多取代; 以及直链或支链C₃-C₈-环烷基-C₁-C₄-烷基, 其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或氰基单取代至二取代,

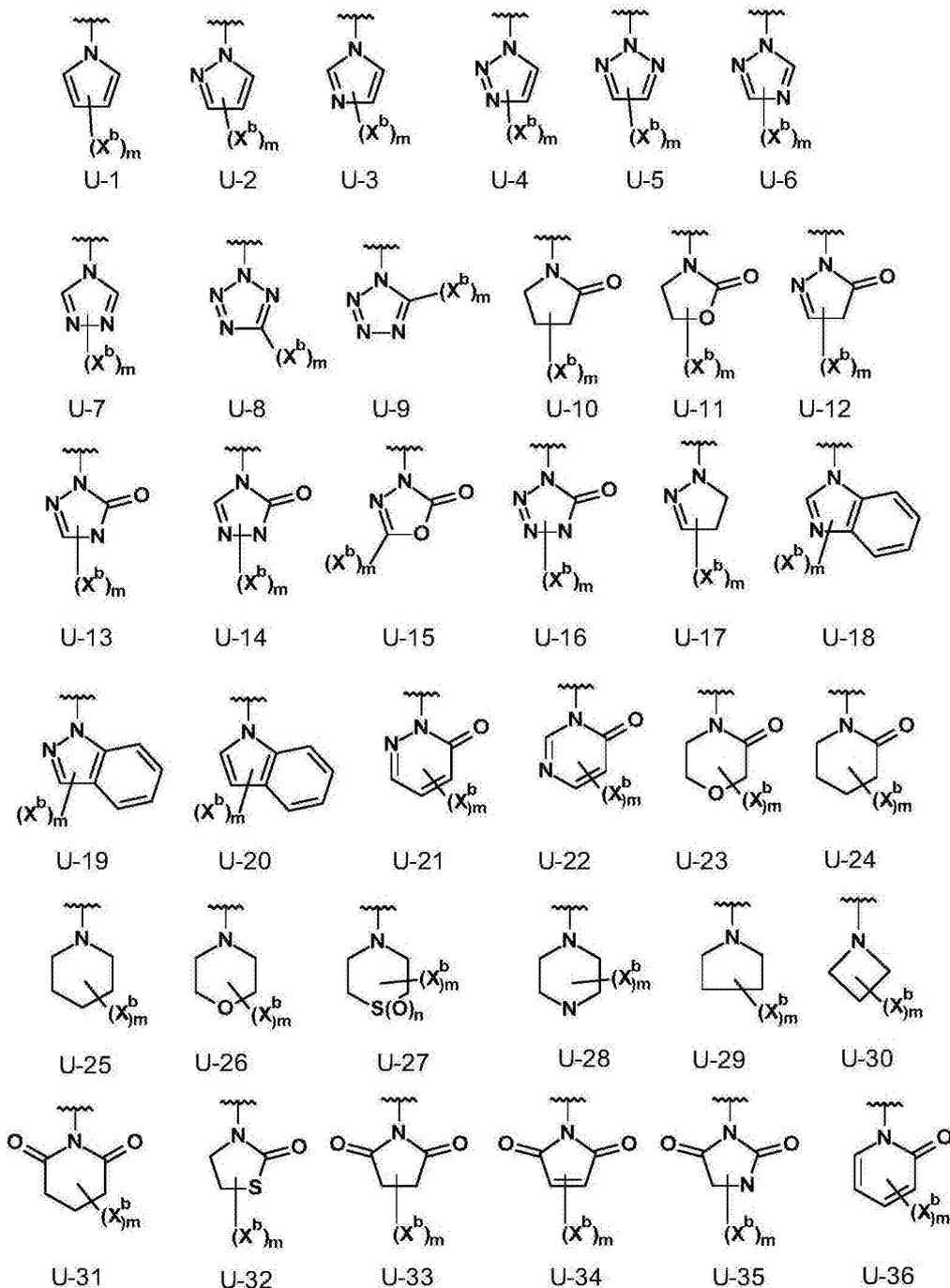
T代表氧或电子对,

L¹代表选自以下的基团: 氢; C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-烯基或C₃-C₆-炔基, 其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-或氰基单取代至三取代; C₃-C₆-环烷基, 其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或氰基单取代至二取代; 以及代表基团C(O)R²、C(O)N(R³)(R⁴)、C(O)OR⁵和SO₂R⁶,

L²代表选自以下的基团: 氢; -N(R^{3a})(R^{4a}); C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-烯基、C₃-C₆-炔基或C₁-C₄-烷氧基, 其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-或氰基单取代至三取代; 直链或支链C₃-C₈-环烷基或C₃-C₈-环烷基-C₁-C₄-烷基, 其任选彼此独立地被O、S(O)_n、CO或NR^{4a}间隔一次或两次, 以及任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或氰基单取代至四取代; 芳基、杂芳基、芳烷基或杂芳基烷基, 其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基-S(O)_n-、硝基或氰基单取代至三取代,

或

L¹和L²与N一起代表选自U-1至U-36的杂环,



X^b 代表选自以下的基团：卤素、硝基、氰基、氨基、 C_1 - C_4 -烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_5 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 C_3 - C_6 -卤代环烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、氰基- C_1 - C_4 -烷基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_4 -烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_3 - C_6 -炔基、 C_1 - C_4 -烷基-S(O)_n、 C_1 - C_4 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -卤代烷基羰基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基、 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、芳基和杂芳基，其中取代基芳基和杂芳基可任选被选自相同或不同的以下取代基单取代或多取代：卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷氧基和 C_1 - C_4 -烷硫基，并且其中U-13、U-14、U-16、U-28和U-35中的环氮原子未被卤素、硝基、氰基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷氧基取代，

或

X^b 代表任选含有1个选自N、S和O的杂原子的 C_2-C_5 -碳链,其连接在两个相邻的环位置上并形成脂族环、芳环、杂芳环或杂环环,在此情况下 m 等于2,

R^2 代表选自以下的基团:氢; C_1-C_8 -烷基、 C_3-C_8 -烯基或 C_3-C_8 -炔基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -烷基-S(O) $_n$ -单取代至多取代; C_3-C_8 -环烷基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基或氰基单取代至二取代;芳基或杂芳基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷基-S(O) $_n$ -、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基-S(O) $_n$ -、硝基或氰基单取代至三取代;以及直链或支链芳基- C_1-C_4 -烷基或杂芳基- C_1-C_4 -烷基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷基-S(O) $_n$ -、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基-S(O) $_n$ -、硝基或氰基单取代至三取代,

R^3 、 R^4 彼此独立地代表选自以下的基团:氢; C_1-C_8 -烷基、 C_3-C_8 -烯基或 C_3-C_8 -炔基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -烷基-S(O) $_n$ -单取代至多取代; C_3-C_8 -环烷基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基或氰基单取代至二取代;芳基或杂芳基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷基-S(O) $_n$ -、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基-S(O) $_n$ -、硝基或氰基单取代至三取代;以及直链或支链芳基- C_1-C_4 -烷基或杂芳基- C_1-C_4 -烷基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷基-S(O) $_n$ -、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基-S(O) $_n$ -、硝基或氰基单取代至三取代,

R^{3a} 代表选自以下的基团:氢; C_1-C_8 -烷基,其任选彼此独立地被卤素、氰基或 C_1-C_4 -烷氧基单取代至多取代; C_3-C_8 -环烷基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基或 C_1-C_4 -烷氧基单取代至二取代;芳基或杂芳基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷基-S(O) $_n$ -、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基-S(O) $_n$ -、硝基或氰基单取代至三取代;以及直链或支链芳基- C_1-C_4 -烷基或杂芳基- C_1-C_4 -烷基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷基-S(O) $_n$ -、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、硝基或氰基单取代至三取代,

R^{4a} 代表选自以下的基团:氢; C_1-C_4 -烷基,其任选彼此独立地被卤素或 C_1-C_4 -烷氧基单取代至多取代; C_3-C_6 -环烷基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基或 C_1-C_4 -烷氧基单取代至二取代;以及代表基C(O) R^2 、C(O)OR 5 和SO $_2R^6$,

R^5 代表 C_1-C_8 -烷基、 C_3-C_8 -烯基或 C_3-C_8 -炔基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -烷基-S(O) $_n$ -单取代至多取代; C_3-C_8 -环烷基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基或氰基单取代至二取代,

R^6 代表选自以下的基团: C_1-C_8 -烷基、 C_3-C_8 -烯基或 C_3-C_8 -炔基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -烷基-S(O) $_n$ -单取代至多取代; C_3-C_8 -环烷基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基或氰基单取代至二取代;芳基或杂芳基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷基-S(O) $_n$ -、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基-S(O) $_n$ -、硝基或氰基单取代至三取代,

m 代表数字0、1、2或3,

n 代表数字0、1或2。

3. 根据权利要求2所述的化合物及其盐,其中

Q代表氧，

V代表选自以下的基团：氢、氟、氯、溴、甲基和乙基，

W代表选自以下的基团：氢、氟、氯、溴、氰基和甲基，

Y代表选自以下的基团：氢；C₁-C₄-烷基、C₃-C₄-烯基或C₃-C₄-炔基，其任选彼此独立地被氟、氯、溴、甲氧基或乙氧基单取代至五取代；以及C₃-C₆-环烷基，其任选彼此独立地被氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基或氰基单取代至二取代，

A代表选自以下的基团：氢；C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-烯基或C₃-C₆-炔基，其任选彼此独立地被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基或氰基单取代至五取代；以及C₃-C₆-环烷基，其任选彼此独立地被氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基或氰基单取代至二取代，

T代表电子对，

L¹和L²与N一起代表选自U-1、U-2、U-3、U-4、U-5、U-6、U-7、U-25、U-26、U-27、U-28、U-29和U-30的杂环，

X^b代表选自以下的基团：卤素、硝基、氰基、氨基、C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₂-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-卤代环烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₆-烷硫基、C₁-C₄-烷氧基羰基、C₁-C₄-烷基氨基羰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₆-烷基羰基氨基和苯基，其中苯基可任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、Me-S(O)_n-、Et-S(O)_n-、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基-S(O)_n-、二氟乙基-S(O)_n-、三氟乙基-S(O)_n-、硝基或氰基单取代至三取代，

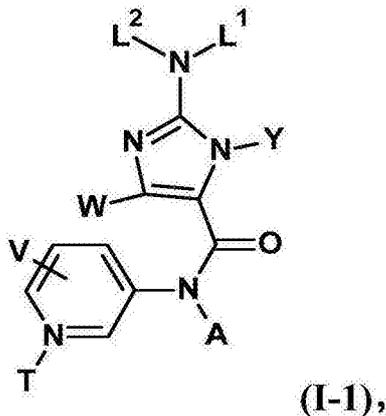
或

X^b代表C₃-C₅-碳链，其连接到两个相邻的环位置上并形成脂族环，在此情况下m等于2，

m代表数字0、1或2，

n代表数字0、1或2。

4. 根据权利要求2所述的化合物及其盐，所述化合物如式(I-1)



其中

V代表选自以下的基团：氢、氟、氯、甲基和氰基，

W代表选自以下的基团：氢、氟、氯、溴和甲基，

Y代表选自以下的基团：甲基、乙基、丙基、烯丙基或炔丙基，其任选彼此独立地被氟、甲氧基、乙氧基或氰基单取代至三取代，

A代表选自以下的基团：氢；甲基、乙基、丙基、烯丙基、炔丙基或环丙基，其任选彼此独立地被氟、甲氧基、乙氧基或氰基单取代至三取代，

T代表电子对，

L¹和L²与N一起代表选自U-1、U-2、U-3、U-4、U-5、U-6、U-7、U-25、U-26、U-27、U-29和U-30的杂环，

X^b代表选自以下的基团：氟、氯、溴、氰基、氨基、甲基、乙基、正丙基和异丙基、环丙基、三氟甲基、二氟甲基、三氟乙基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基和异丙氧基、三氟甲氧基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基乙基、甲基-S(O)_n-、乙基-S(O)_n-、甲氧基羰基、乙氧基羰基、甲基氨基羰基、甲基羰基氨基或苯基，其中苯基可任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、硝基或氰基单取代至三取代，

或

X^b代表C₃-C₄-碳链，其连接到两个相邻的环位置上并形成脂族环，在此情况下m等于2，

m代表数字0、1或2，

n代表数字0、1或2。

5. 根据权利要求4所述的化合物及其盐，其中

V代表氢，

W代表氢，

Y代表选自以下的基团：氢、甲基、乙基、烯丙基和炔丙基，

A代表选自以下的基团：氢、甲基、乙基和环丙基，

T代表电子对，

L¹和L²与N一起代表选自U-1、U-2、U-3、U-6、U-25、U-26和U-29的杂环，

X^b代表选自以下的基团：氟、氯、溴、氰基、氨基、甲基、乙基、正丙基和异丙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲硫基和苯基、其中苯基可任选被氟、氯、甲基或甲氧基单取代至三取代，

或

X^b代表C₃-C₄-碳链，其连接到两个相邻的环位置上并形成脂族环，在此情况下m等于2，

m代表数字0、1或2。

6. 根据权利要求4所述的化合物及其盐，其中

V代表氢，

W代表氢，

Y代表甲基，

A代表甲基、乙基或环丙基，

T代表电子对，

L¹和L²与N一起代表选自U-1、U-2、U-3、U-6、U-25、U-26和U-29的杂环，

X^b代表选自以下的基团：氯、氰基、氨基、甲基、异丙基、三氟甲基、甲硫基和苯基，

或

X^b代表-(CH₂)₃-，其连接到两个相邻的环位置上并形成脂族环，在此情况下m等于2，

m代表数字0、1或2。

7. 组合物，其包含至少一种权利要求1至6中任一项所述的化合物和常规的增量剂和/或表面活性剂，所述常规的增量剂和/或表面活性剂特别用于防治动物害虫。

8. 防治动物害虫的方法，其中使至少一种权利要求1-6中任一项所述的化合物或权利要求7所述的组合物作用于动物害虫和/或其生境。

9. 至少一种权利要求1至6中任一项所述的化合物或权利要求7所述的组合物用于防治动物害虫的用途。

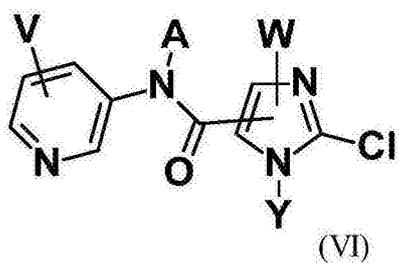
10. 根据权利要求9所述的方法或根据权利要求9所述的用途, 其中排除对人体或动物体的外科手术处理、治疗性处理和诊断性处理。

11. 至少一种权利要求1至6中任一项所述的化合物用于保护植物繁殖材料的用途。

12. 农用化学制剂, 其包含基于农用化学制剂的重量计的0.00000001重量%至98重量%的生物有效量的至少一种权利要求1至6中任一项所述的化合物, 以及包含增量剂和/或表面活性剂。

13. 根据权利要求12所述的农用化学制剂, 还包含其他农用化学活性化合物。

14. 式(VI)的中间体



其中, 基团具有权利要求1至6任一项所述的含义, 且特别优选具有权利要求6所述的含义。

作为害虫防治剂的取代的咪唑基羧酰胺

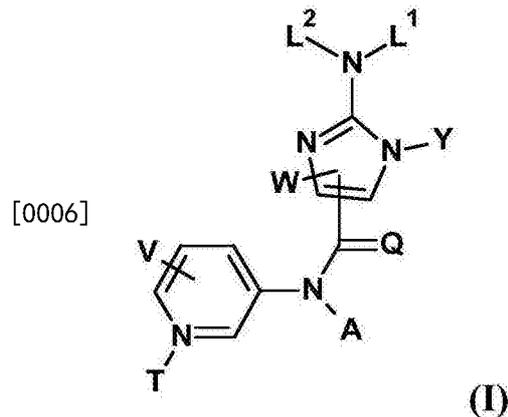
[0001] 本发明涉及新的杂环化合物,用于其制备的方法和中间体及其用于防治动物害虫的用途。

[0002] WO 2011/009804 A2记载了尤其包括可用作杀虫剂的咪唑基羧酰胺的杂环化合物。然而,没有记载在咪唑基环上用氨基基团直接取代的咪唑基羧酰胺。WO 2011/009804 A2中列举的咪唑基羧酰胺在其杀虫活性方面具有明显的弱点。

[0003] 现代杀虫剂必须满足许多要求,例如关于它们的作用程度、作用持久性和作用谱以及可能的用途。毒性、有益物种和传粉者的保护、环境特性、施用率、与其他活性成分或制剂助剂的可结合性这些问题起到了作用,用于合成活性成分所需的努力的问题也起作用;此外,就仅提及的一些参数而言,可能产生抗性。仅出于所有这些原因,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。

[0004] 本发明的目的是提供在多个方面拓宽农药谱的化合物。

[0005] 该目的以及未明确说明但可从本文讨论的内容推出或得出的其他目的通过提供式(I)的化合物及其盐来实现,



[0007] 其中(实施方案(0))

[0008] Q代表氧或硫,

[0009] V代表选自以下的基团:氢、卤素、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基和氰基,

[0010] W代表选自以下的基团:氢、卤素、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基和氰基,

[0011] Y代表选自以下的基团:氢,氰基,任选取代的烷基、烯基或炔基,任选地被杂原子间隔的任选取代的环烷基,任选地被杂原子间隔的任选取代的环烷基烷基,芳烷基或杂芳基烷基,

[0012] A代表选自以下的基团:氢,任选取代的烷基、烯基或炔基以及任选地被杂原子间隔的任选取代的环烷基或环烷基烷基,

[0013] T代表氧或电子对,

[0014] L¹代表选自以下的基团:氢,任选取代的烷基、烯基、炔基,或环烷基,以及代表基团C(O)R²、C(O)N(R³)(R⁴)、C(O)OR⁵和SO₂R⁶,

[0015] L²代表选自以下的基团:氢,N(R^{3a})(R^{4a}),任选取代的烷基、烯

[0016] 基、炔基或烷氧基,任选地被杂原子间隔的任选取代的环烷基或环烷基烷基,以及任选取代的芳基、芳烷基、杂芳基或杂芳基烷基,

[0017] 或

[0018] L^1 和 L^2 与它们所连接的氮原子一起代表具有3至7个环原子的任选取代的饱和杂环、部分饱和杂环或芳族杂环,其可任选地被其他杂原子和/或被一个或两个C=O基团间隔,

[0019] R^2 代表选自以下的基团:氢,任选取代的烷基、烯基或炔基,任选取代的环烷基,任选取代的芳基或杂芳基以及任选取代的芳烷基或杂芳基烷基,

[0020] R^3 和 R^4 彼此独立地代表选自以下的基团:氢,任选取代的烷基、烯基或炔基,任选取代的饱和或不饱和的环烷基、环烷基烷基、芳基、杂芳基、芳烷基或杂芳基烷基,

[0021] 或

[0022] R^3 和 R^4 一起形成任选取代的3-元至7-元脂族环,其任选含有氮原子、硫原子或氧原子,

[0023] R^{3a} 代表选自以下的基团:氢,任选取代的烷基,任选取代的环烷基、芳基、杂芳基、芳烷基或杂芳基烷基,

[0024] R^{4a} 代表选自以下的基团:氢、任选取代的烷基、任选取代的 C_3 - C_6 -环烷基,以及代表基C(O) R^2 、C(O)OR⁵和SO₂R⁶,

[0025] R^5 代表任选取代的烷基、烯基或炔基,任选取代的环烷基或环烷基烷基,

[0026] R^6 代表选自以下的基团:任选取代的烷基、烯基或炔基,任选取代的环烷基、环烷基烷基、芳基、芳烷基、杂芳基或杂芳基烷基。

[0027] 式(I)的化合物及其盐中列出的优选的取代基或基团的范围如下所示。其结合形成优选范围(1-1)。

[0028] Q代表氧或硫,

[0029] V代表选自以下的基团:氢、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 -卤代烷氧基和氰基,

[0030] W代表选自以下的基团:氢、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 -卤代烷氧基和氰基,

[0031] Y代表选自以下的基团:氢; C_1 - C_6 -烷基、 C_3 - C_6 -烯基或 C_3 - C_6 -炔基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷基-S(O)_n-或氰基单取代至多取代; C_3 - C_8 -环烷基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基或氰基单取代至二取代;直链或支链 C_3 - C_8 -环烷基- C_1 - C_4 -烷基,其任选彼此独立地被O、S(O)_n、CO或NR^{4a}间隔一次或两次,以及任选彼此独立地被卤素、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基或氰基单取代至四取代;芳基- C_1 - C_4 -烷基或杂芳基- C_1 - C_4 -烷基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷基-S(O)_n-、 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 C_1 - C_4 -卤代烷基-S(O)_n-、硝基或氰基单取代至三取代,

[0032] A代表选自以下的基团:氢; C_1 - C_6 -烷基、 C_3 - C_6 -烯基或 C_3 - C_6 -炔基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷基-S(O)_n-或氰基单取代至多取代; C_3 - C_6 -环烷基或 C_3 - C_8 -环烷基- C_1 - C_4 -烷基,其任选彼此独立地被卤素、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基或氰基单取代至二取代;以及 C_1 - C_6 -烷基、 C_3 - C_6 -烯基或 C_3 - C_6 -炔基,其任选彼此独立地被卤

素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-或氰基单取代至多取代；以及直链或支链C₃-C₈-环烷基-C₁-C₄-烷基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或氰基单取代至二取代，

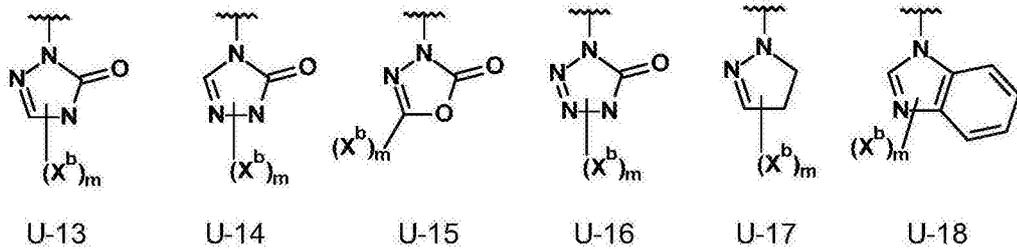
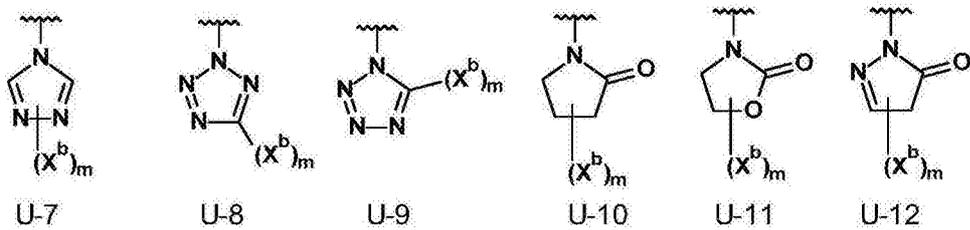
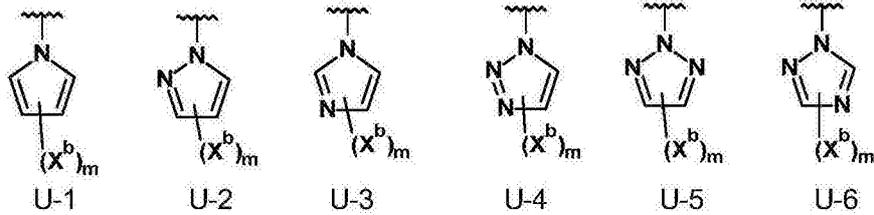
[0033] T代表氧或电子对，

[0034] L¹代表选自以下的基团：氢；C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-烯基或C₃-C₆-炔基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-或氰基单取代至三取代；C₃-C₆-环烷基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或氰基单取代至二取代；以及代表基团C(O)R²、C(O)N(R³)(R⁴)、C(O)OR⁵和SO₂R⁶，

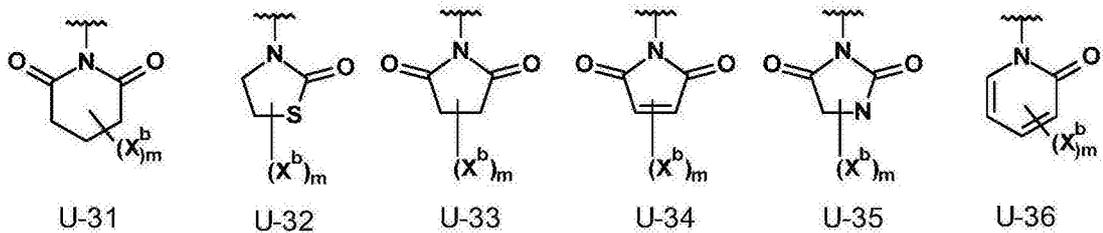
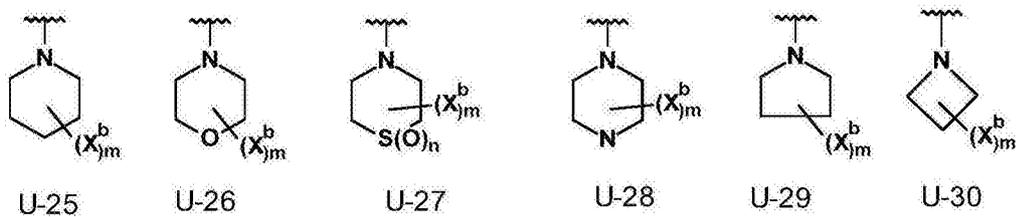
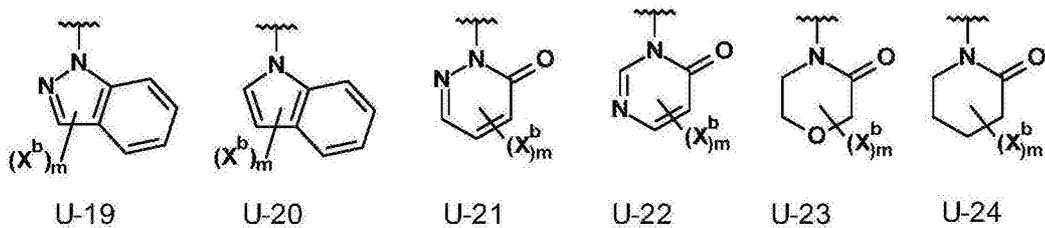
[0035] L²代表选自以下的基团：氢；-N(R^{3a})(R^{4a})、C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-烯基、C₃-C₆-炔基或C₁-C₄-烷氧基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-或氰基单取代至三取代；直链或支链C₃-C₈-环烷基或C₃-C₈-环烷基-C₁-C₄-烷基，其任选彼此独立地被O、S(O)_n、CO或NR^{4a}间隔一次或两次，以及任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或氰基单取代至四取代；芳基、杂芳基、芳烷基或杂芳基烷基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基-S(O)_n-、硝基或氰基单取代至三取代，

[0036] 或

[0037] L¹和L²与N一起代表选自U-1至U-36的杂环，



[0038]



[0039] X^b 代表选自以下的基团:卤素、硝基、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_5 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 C_3 - C_6 -卤代环烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、氰基- C_1 - C_4 -烷基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_4 -烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_3 - C_6 -炔基、 C_1 - C_4 -烷基- $S(O)_n$ 、 C_1 - C_4 -烷基羰基、 C_1 - C_6 -卤代烷基羰基、 C_1 - C_6 -烷氧基羰基、 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、芳基和杂芳基,其中取代基芳基和杂芳基可任选被选自相同或不同的以下取代基单取代或多取代:卤素、氰基、硝基、 C_1 - C_6 -烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_6 -卤代烷氧基和 C_1 - C_4 -烷硫基,并且其中U-13、

U-14、U-16、U-28和U-35中的环氮原子未被卤素、硝基、氰基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷氧基取代，

[0040] R²代表选自以下的基团：氢；C₁-C₈-烷基、C₃-C₈-烯基或C₃-C₈-炔基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷氧基或C₁-C₄-烷基-S(O)_n-单取代至多取代；C₃-C₈-环烷基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或氰基单取代至二取代；芳基或杂芳基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基-S(O)_n-、硝基或氰基单取代至三取代；以及直链或支链芳基-C₁-C₄-烷基或杂芳基-C₁-C₄-烷基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基-S(O)_n-、硝基或氰基单取代至三取代，

[0041] R³、R⁴彼此独立地代表选自以下的基团：氢；C₁-C₈-烷基、C₃-C₈-烯基或C₃-C₈-炔基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷氧基或C₁-C₄-烷基-S(O)_n-单取代至多取代；C₃-C₈-环烷基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或氰基单取代至二取代；芳基或杂芳基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基-S(O)_n-、硝基或氰基单取代至三取代；以及直链或支链芳基-C₁-C₄-烷基或杂芳基-C₁-C₄-烷基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基-S(O)_n-、硝基或氰基单取代至三取代，

[0042] R^{3a}代表选自以下的基团：氢；C₁-C₈-烷基，其任选彼此独立地被卤素、氰基或C₁-C₄-烷氧基单取代至多取代；C₃-C₈-环烷基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基或C₁-C₄-烷氧基单取代至二取代；芳基或杂芳基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基-S(O)_n-、硝基或氰基单取代至三取代；以及直链或支链芳基-C₁-C₄-烷基或杂芳基-C₁-C₄-烷基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-、C₁-C₄-卤代烷氧基、硝基或氰基单取代至三取代，

[0043] R^{4a}代表选自以下的基团：氢；C₁-C₄-烷基，其任选彼此独立地被卤素或C₁-C₄-烷氧基单取代至多取代；C₃-C₆-环烷基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基或C₁-C₄-烷氧基单取代至二取代；以及代表基团C(O)R²、C(O)OR⁵和SO₂R⁶，

[0044] R⁵代表C₁-C₈-烷基、C₃-C₈-烯基或C₃-C₈-炔基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷氧基或C₁-C₄-烷基-S(O)_n-单取代至多取代；C₃-C₈-环烷基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或氰基单取代至二取代，

[0045] R⁶代表选自以下的基团：C₁-C₈-烷基、C₃-C₈-烯基或C₃-C₈-炔基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷氧基或C₁-C₄-烷基-S(O)_n-单取代至多取代；C₃-C₈-环烷基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基或氰基单取代至二取代；芳基或杂芳基，其任选彼此独立地被卤素、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基-S(O)_n-、硝基或氰基单取代至三取代，

[0046] m代表数字0、1、2或3，

[0047] n代表数字0、1或2。

[0048] 式(I)的化合物及其盐中列出的基的进一步优选的取代基或基团范围如下所示。

其结合形成优选范围(1-2),其中

[0049] Q、V、W、Y、A、T、L¹、L²、R²、R³、R⁴、R^{3a}、R^{4a}、R⁵、R⁶、m和n如优选范围(1-1)中所定义,且

[0050] X^b代表选自以下的基团:卤素、硝基、氰基、氨基、C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₅-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-卤代环烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基、C₂-C₆-烯基、C₃-C₆-炔基、C₁-C₄-烷基-S(O)_n-、C₁-C₄-烷基羰基、C₁-C₆-卤代烷基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基、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、芳基和杂芳基,其中取代基芳基和杂芳基可任选被相同或不同的选自以下的取代基单取代或多取代:卤素、氰基、硝基、C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₆-卤代烷氧基和C₁-C₄-烷硫基,并且其中U-13、U-14、U-16和U-28中的环氮原子未被卤素、硝基、氰基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷氧基取代,

[0051] 或

[0052] X^b代表任选含有1个选自N、S和O的杂原子的C₂-C₅-碳链,其连接在两个相邻的环位置上并形成脂族环、芳环、杂芳环或杂环环,在此情况下m等于2。

[0053] 式(I)的化合物及其盐中列出的特别优选的取代基或基团的范围如下所示。其结合形成优选范围(2-1)。

[0054] Q代表氧,

[0055] V代表选自以下的基团:氢、氟、氯、溴、甲基和乙基,

[0056] W代表选自以下的基团:氢、氟、氯、溴、氰基和甲基,

[0057] Y代表选自以下的基团:氢;C₁-C₄-烷基、C₃-C₄-烯基或C₃-C₄-炔基,其任选彼此独立地被氟、氯、溴、甲氧基或乙氧基单取代至五取代;以及C₃-C₆-环烷基,其任选彼此独立地被氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基或氰基单取代至二取代,

[0058] A代表选自以下的基团:氢;C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-烯基或C₃-C₆-炔基,其任选彼此独立地被氟、氯、溴、甲氧基、乙氧基或氰基单取代至五取代;以及C₃-C₆-环烷基,其任选彼此独立地被氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基或氰基单取代至二取代,

[0059] T代表电子对,

[0060] L¹和L²与N一起代表选自U-1、U-2、U-3、U-4、U-5、U-6、U-7、U-25、U-26、U-27、U-28、U-29和U-30的杂环,

[0061] X^b代表选自以下的基团:卤素、硝基、氰基、C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₂-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-卤代环烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₆-烷硫基、C₁-C₄-烷氧基羰基、C₁-C₄-烷基氨基羰基、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₆-烷基羰基氨基和苯基,其中苯基可任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、Me-S(O)_n-、Et-S(O)_n-、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基-S(O)_n-、二氟乙基-S(O)_n-、三氟乙基-S(O)_n-、硝基或氰基单取代至三取代,

[0062] m代表数字0、1或2,

[0063] n代表数字0、1或2。

[0064] 式(I)的化合物及其盐中列出的进一步优选的取代基或基团范围如下所示。其结合形成优选范围(2-2),其中

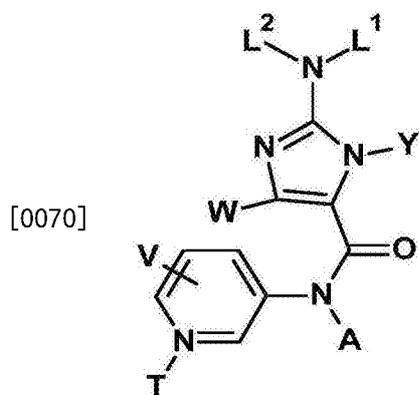
[0065] Q、V、W、Y、A、T、L¹、L²、m和n如优选范围(2-1)中所定义,且

[0066] X^b 代表选自以下的基团:卤素、硝基、氰基、氨基、 C_1 - C_4 -烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_2 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 C_3 - C_6 -卤代环烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_6 -烷硫基、 C_1 - C_4 -烷氧基羰基、 C_1 - C_4 -烷基氨基羰基、 C_1 - C_6 -烷基磺酰基、 C_1 - C_6 -烷基羰基氨基和苯基,其中苯基可任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、 $Me-S(O)_n-$ 、 $Et-S(O)_n-$ 、二氟甲氧基、三氟甲氧基、三氟甲基- $S(O)_n-$ 、二氟乙基- $S(O)_n-$ 、三氟乙基- $S(O)_n-$ 、硝基或氰基单取代至三取代,

[0067] 或

[0068] X^b 代表 C_3 - C_5 -碳链,其连接到两个相邻的环位置上并形成脂族环,在此情况下 m 等于2。

[0069] 式(I)的化合物及其盐中列出的非常特别优选的取代基或基团的范围如下所示。考虑到酰胺基团在咪唑基上的位置,得到非常特别优选的结构(I-1)。其结合形成优选范围(3-1)。



[0071] V代表选自以下的基团:氢、氟、氯、甲基和氰基,

[0072] W代表选自以下的基团:氢、氟、氯、溴和甲基,

[0073] Y代表选自以下的基团:甲基、乙基、丙基、烯丙基或炔丙基,其任选彼此独立地被氟、甲氧基、乙氧基或氰基单取代至三取代,

[0074] A代表选自以下的基团:氢和甲基、乙基、丙基、烯丙基、炔丙基或环丙基,其任选彼此独立地被氟、甲氧基、乙氧基或氰基单取代至三取代,

[0075] T代表电子对,

[0076] L^1 和 L^2 与N一起代表选自U-1、U-2、U-3、U-4、U-5、U-6、U-7、U-25、U-26、U-27、U-29和U-30的杂环,

[0077] X^b 代表选自以下的基团:氟、氯、溴、氰基、甲基、乙基、正丙基和异丙基、环丙基、三氟甲基、二氟甲基、三氟乙基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基和异丙氧基、三氟甲氧基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基乙基、甲基- $S(O)_n-$ 、乙基- $S(O)_n-$ 、甲氧基羰基、乙氧基羰基、甲基氨基羰基、甲基羰基氨基或苯基,其中苯基可任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、硝基或氰基单取代至三取代,

[0078] m 代表数字0、1或2,

[0079] n 代表数字0、1或2。

[0080] 考虑到酰胺基团在咪唑基上的位置,式(I)给出非常特别优选的结构(I-1)。式(I-1)的化合物及其盐中所列的非常特别优选的取代基或基团的范围如下所示。它们的结

合形成了优选范围 (3-2),

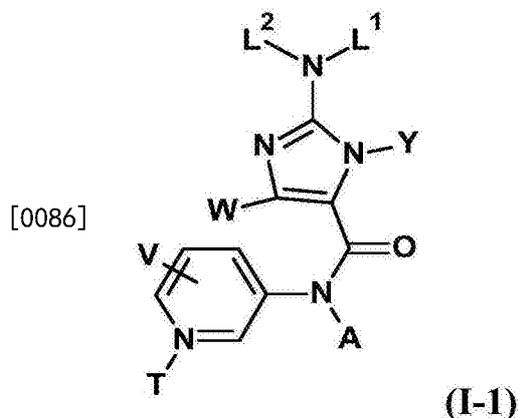
[0081] 其中V、W、Y、A、T、L¹、L²、m和n如优选范围 (3-1) 中所定义,且

[0082] X^b代表选自以下的基团:氟、氯、溴、氰基、氨基、甲基、乙基、正丙基和异丙基、环丙基、三氟甲基、二氟甲基、三氟乙基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基和异丙氧基、三氟甲氧基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基乙基、甲基-S(O)_n-、乙基-S(O)_n-、甲氧基羰基、乙氧基羰基、甲基氨基羰基、甲基羰基氨基或苯基,其中苯基可任选被氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、硝基或氰基单取代至三取代,

[0083] 或

[0084] X^b代表C₃-C₅-碳链,其连接到两个相邻的环位置上并形成脂族环,在此情况下m等于2。

[0085] 式 (I-1) 的化合物及其盐中所列的尤其优选的取代基或基团的范围如下所示。它们与尤其优选的取代基的组合形成了优选范围 (4-1),其中



[0087] V代表氢,

[0088] W代表氢,

[0089] Y代表选自以下的基团:氢、甲基、乙基、烯丙基和炔丙基,

[0090] A代表选自以下的基团:氢、甲基和乙基,

[0091] T代表电子对,

[0092] L¹和L²与N一起代表选自U-1、U-2、U-3、U-6、U-25、U-26和U-29的杂环,

[0093] X^b代表选自以下的基团:氟、氯、溴、氰基、甲基、乙基、正丙基和异丙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲硫基和苯基,其中苯基可任选被氟、氯、甲基或甲氧基单取代至三取代,

[0094] m代表数字0、1或2。

[0095] 式 (I-1) 的化合物及其盐中所列的尤其优选的取代基或基团的范围如下所示。它们与特别优选的取代基的结合形成了优选范围 (4-2),其中

[0096] V、W、Y、T、L¹、L²和m如优选范围 (4-1) 中所定义,以及

[0097] A代表选自以下的基团:氢、甲基、乙基和环丙基,且

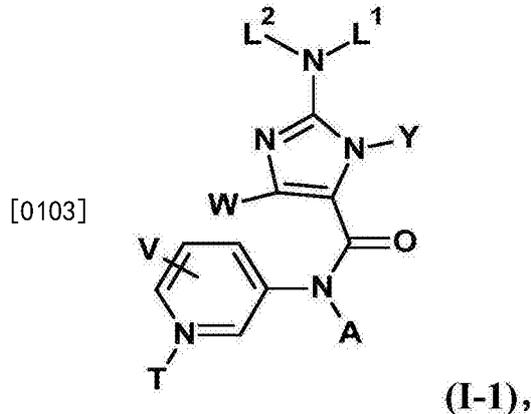
[0098] X^b代表选自以下的基团:氟、氯、溴、氰基、氨基、甲基、乙基、正丙基和异丙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲硫基和苯基,其中苯基可任选被氟、氯、甲基或甲氧基单取代至三取代,

[0099] 或

[0100] X^b代表C₃-C₄-碳链,其连接到两个相邻的环位置上并形成脂族环,

[0101] 在此情况下m等于2。

[0102] 式(I-1)的化合物及其盐中所列的非常特别优选的取代基或基团的范围如下所示。其组合形成了优选范围(5-1)。



[0104] V代表氢，

[0105] W代表氢，

[0106] Y代表甲基，

[0107] A代表甲基或乙基，

[0108] T代表电子对，

[0109] L¹和L²与N一起代表选自U-1、U-2、U-3、U-6、U-25、U-26和U-29的杂环，

[0110] X^b代表选自以下的基团：氯、氰基、甲基、三氟甲基、甲硫基和苯基，

[0111] m代表数字0、1或2。

[0112] 式(I-1)的化合物及其盐中所列的非常特别优选的取代基或基团的范围如下所示。其结合形成了优选范围(5-2)，

[0113] 其中

[0114] V、W、Y、T、L¹、L²和m如优选范围(5-1)中所定义，且

[0115] A代表甲基、乙基或环丙基，且

[0116] X^b代表选自以下的基团：氯、氰基、氨基、甲基、异丙基、三氟甲基、甲硫基和苯基，

[0117] 或

[0118] X^b代表-(CH₂)₃，其连接到两个相邻的环位置上并形成脂族环，在此情况下m等于2。

[0119] 在优选的实施方案中，本发明涉及式(I)的化合物或式(I-1)的化合物，其中基团Q、V、W、Y、A、T和n如优选范围(1-1)或优选范围(1-2)或优选范围(2-1)或优选范围(2-2)或优选范围(3-1)或优选范围(3-2)或优选范围(4-1)或优选范围(4-2)或优选范围(5-1)或优选范围(5-2)中所定义，以及

[0120] L¹、L²、X^b、R²、R³、R⁴、R^{3a}、R^{4a}、R⁵、R⁶和m具有实施方案(0)中所述的含义。

[0121] 在优选的实施方案中，本发明涉及式(I)的化合物或式(I-1)的化合物，其中基团Q、V、W、Y、A、T和n如实施方案(0)或优选范围(2-1)或优选范围(2-2)或优选范围(3-1)或优选范围(3-2)或优选范围(4-1)或优选范围(4-2)或优选范围(5-1)或优选范围(5-2)中所定义，以及

[0122] L¹、L²、X^b、R²、R³、R⁴、R^{3a}、R^{4a}、R⁵、R⁶和m具有优选范围(1-1)或(1-2)中所述的含义。

[0123] 在优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物或式(I-1)的化合物,其中基团Q、V、W、Y、A、T和n如实施方案(0-1)或实施例(0-2)或优选范围(1-1)或优选范围(1-2)或优选范围(3-1)或优选范围(3-2)或优选范围(4-1)或优选范围(4-2)或优选范围(5-1)或优选范围(5-2)中所定义,以及

[0124] L^1 、 L^2 、 X^b 和m具有优选范围(2-1)或(2-2)中所述的含义。

[0125] 在优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物或式(I-1)的化合物,其中基团Q、V、W、Y、A、T和n如实施方案(0-1)或实施例(0-2)或优选范围(1-1)或优选范围(1-2)或优选范围(2-1)或优选范围(2-2)或优选范围(4-1)或优选范围(4-2)或优选范围(5-1)或优选范围(5-2)中所定义,以及

[0126] L^1 、 L^2 、 X^b 和m具有优选范围(3-1)或(3-2)中所述的含义。

[0127] 在优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物或式(I-1)的化合物,其中基团Q、V、W、Y、A、T和n如实施方案(0-1)或实施方案(0-2)或优选范围(1-1)或优选范围(1-2)或优选范围(2-1)或优选范围(2-2)或优选范围(3-1)或优选范围(3-2)或优选范围(5-1)或优选范围(5-2)中所定义,以及

[0128] L^1 、 L^2 、 X^b 和m具有优选范围(4-1)或优选范围(4-2)中所述的含义。

[0129] 在优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物或式(I-1)的化合物,其中基团Q、V、W、Y、A、T和n如实施方案(0-1)或实施方案(0-2)或优选范围(1-1)或优选范围(1-2)或优选范围(2-1)或优选范围(2-2)或优选范围(3-1)或优选范围(3-2)或优选范围(4-1)或优选范围(4-2)中所定义,且

[0130] L^1 、 L^2 、 X^b 和m具有优选范围(5-1)或优选范围(5-2)中所述的含义。

[0131] 在优选范围(1-1)或(1-2)中,除非另有说明,

[0132] 卤素选自氟、氯、溴和碘,优选依次选自氟、氯和溴,

[0133] 杂芳基(hetaryl)(与杂芳基(heteroaryl)同义,包括作为更大单元(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、吡啶基、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、苯并噻吩基、苯并异噻吩基、吡啶基、异吡啶基、吡啶基、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、喹唑啉基、喹喔啉基、茶啶基、苯并三嗪基、嘌呤基、蝶啶基和中氮茛基,

[0134] 杂环基代表饱和的3-元、4-元、5-元或6-元环,其含有1或2个氮原子和/或一个氧原子和/或一个硫原子,但是其中2个氮原子不应直接相邻,例如氮杂环丙基(aziridinyl)、氮杂环丁基(azetidiny)、氮杂环戊基(azolidinyl)、氮杂环己基(azinanyl)、氧杂环丙基(oxiranyl)、氧杂环丁基(oxetanyl)、氧杂环戊基(oxolanyl)、氧杂环己基(oxanyl)、二氧杂环己基(dioxanyl)、硫杂环丙基(thiiranyl)、硫杂环丁基(thietanyl)、硫杂环戊基(thiolanyl)、噻烷基(thianyl)和四氢呋喃基。

[0135] 在优选范围(2-1)或(2-2)中,除非另有说明,

[0136] 卤素代表氟、氯、溴和碘,优选氟、氯和溴,

[0137] 杂芳基(包括作为更大单元(如杂芳基烷基)的一部分的杂芳基)代表吡啶基、嘧啶基、噻唑基、噁唑基、吡唑基、噻吩基、呋喃基、苜基、吡啶基甲基和噻唑基甲基,并且

[0138] 杂环基(包括作为更大单元(如杂环基烷基)的一部分的杂环基)代表饱和或不饱和的3-元、4-元或5-元环,其含有1或2个氮原子和/或一个氧原子和/或一个硫原子,但是其中2个氮原子不应直接相邻,例如1-氮杂环丙基或2-氮杂环丙基、2-氧杂环丙基、2-硫杂环丙基、1-氮杂环丁基或2-氮杂环丁基、2-氧杂环丁基或3-氧杂环丁基、2-硫杂环丁基或3-硫杂环丁基、1,3-二氧杂环己-2-基、1-吡咯烷基、2-吡咯烷基或3-吡咯烷基。

[0139] 在优选范围(3-1)或(3-2)中,除非另有说明,

[0140] 卤素代表氟、氯、溴和碘,优选氟、氯和溴,以及

[0141] 杂环基(包括作为更大单元(如杂环基烷基)的一部分的杂环基)代表饱和或不饱和的3-或4-元环,其含有1或2个氮原子和/或一个氧原子和/或一个硫原子,但是其中2个氮原子不应直接相邻,例如1-氮杂环丙基或2-氮杂环丙基、2-氧杂环丙基、2-硫杂环丙基、1-氮杂环丁基或2-氮杂环丁基、2-氧杂环丁基或3-氧杂环丁基、2-硫杂环丁基或3-硫杂环丁基,或者1,3-二氧杂环己-2-基。除非另有说明,卤素取代的基团(例如卤代烷基)为单卤代或多卤代(最高达最大可能数目的取代基)。在多卤代的情况下,卤素原子可以相同或不同。在此情况下,卤素为氟、氯、溴或碘,尤其为氟、氯或溴。

[0142] 饱和或不饱和烃基(例如烷基或烯基)各自可为直链或支链的,如果可能,包括与杂原子结合,例如烷氧基。

[0143] 除非另有说明,任选取代的基团可为单取代或多取代的,其中在多取代的情况下,取代基可以相同或不同。

[0144] 在式(I)的化合物中,如果T代表氧,则这些化合物以N-氧化物的形式存在。

[0145] 在式(I)的化合物中,如果T代表电子对,则这些化合物以吡啶的形式存在。

[0146] 在一般术语中给出或列于优选范围内的基定义或说明相应地适用于最终产物且适用于原料以及中间体。这些基定义可以按需要彼此结合,即包括各优选范围之间的结合。

[0147] 根据本发明,优选使用含有上文作为优选列出含义的结合(优选范围(1-1)或(1-2))的式(I)化合物。

[0148] 根据本发明,特别优选使用含有上文作为特别优选列出含义的结合(优选范围(2-1)或(2-2))的式(I)化合物,。

[0149] 根据本发明,非常特别优选使用含有上文作为非常特别优选列出定义的结合(优选范围(3-1)或(3-2))的式(I)化合物。

[0150] 根据本发明,特别优选使用含有上文作为非常特别优选列出定义的结合(优选范围(4-1)或(4-2))的式(I)化合物。

[0151] 根据本发明,甚至更优选使用含有上文作为非常特别优选列出定义的结合(优选范围(5-1)或(5-2))的式(I)的化合物。

[0152] 在下文中,关于式(I)的化合物的说明当然也适用于式(I)所包括的式(I-1)的化合物。

[0153] 异构体

[0154] 根据取代基的性质,式(I)的化合物可为几何异构体和/或光学活性异构体或相应的具有不同组成的异构体混合物。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和任何所需的这些异构体的混合物。

[0155] 方法和用途

[0156] 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中、以及在材料保护中进行。这优选排除用于人体或动物体的外科处理或治疗处理的方法以及在人体或动物体上进行的诊断方法。

[0157] 本发明还涉及式(I)的化合物作为农药的用途,尤其是作为作物保护剂的用途。

[0158] 在本申请的上下文中,术语“农药”在每种情况下通常还包括术语

[0159] “作物保护剂”。

[0160] 鉴于良好的植物耐受性、有利的温血动物毒性和良好的环境相容性,式(I)的化合物适用于保护植物和植物器官抵抗生物和非生物胁迫因素、增加采收产量、提高采收材料的品质以及防治在农业、园艺业、畜牧业、水产养殖业、林业、园林以及休闲设施、储存产品和材料的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,尤其是线虫和软体动物。

[0161] 在本专利申请的上下文中,术语“卫生”应被理解为意指旨在预防疾病、特别是感染性疾病并且用于保护人类和动物健康和/或保护环境和/或保持清洁的任何和所有措施、方法和步骤。根据本发明,这尤其包括用于清洁、消毒和灭菌,如纺织品或硬质表面,特别是由玻璃、木材、水泥、瓷器、陶瓷、塑料或金属(多种金属)制成的表面,以保证它们免于卫生害虫和/或其分泌物的措施。在这方面,本发明的保护范围优选排除用于人体或动物体的外科或治疗处理方法以及在人体或动物体上实施的诊断方法。

[0162] 术语“卫生领域”包括其中卫生措施、方法和步骤重要的所有领域、技术领域和工业应用,例如关于在厨房、面包房、机场、浴室、游泳池、百货商店、酒店、医院、厩舍、动物饲养等中的卫生。

[0163] 因此,术语“卫生害虫”应被理解为意指一种或多种这样的动物害虫,其在卫生领域中的存在是成问题的,特别是出于健康原因。因此,主要目的是将卫生害虫的存在和/或在卫生领域中的暴露避免或限制到最少程度。这可以特别通过使用农药来实现,所述农药可用于预防侵染和防治已存在的侵染。也可以使用防止或减少与害虫接触的制剂。卫生害虫包括例如下文提到的生物体。

[0164] 因此,术语“卫生保护”包括用于维持和/或改善所述卫生措施、方法和步骤的所有行为。

[0165] 式(I)的化合物可优选用作农药。它们能有效抵抗通常敏感和抗性的物种,以及抵抗所有或特定的发育阶段。上述害虫包括:

[0166] 节肢动物门(Arthropoda)、尤其是蛛形纲(Arachnida)的害虫,例如粉螨属(例如粗脚粉螨(*Acarus siro*)、枸杞瘤瘿螨(*Aceria kuko*)、柑橘瘤瘿螨(*Aceria sheldoni*))、刺皮瘿螨属(*Aculops* spp.)、针刺瘿螨属(*Aculus* spp.) (例如佛氏刺瘿螨(*Aculus fockeui*)、苹果刺瘿螨(*Aculus schlechtendali*))、花婢属(*Amblyomma* spp.)、山楂叶螨(*Amphitetranychus viennensis*)、锐缘婢属(*Argas* spp.)、牛婢属(*Boophilus* spp.)、短须螨属(*Brevipalpus* spp.) (例如紫红短须螨(*Brevipalpus phoenicis*))、蚜苔螨(*Bryobia graminum*)、苜蓿苔螨(*Bryobia praetiosa*)、刺尾蝎属(*Centruroides* spp.)、皮

螨属 (*Chorioptes* spp.)、鸡皮刺螨 (*Dermanyssus gallinae*)、欧洲屋尘螨 (*Dermatophagoides pteronyssinus*)、美洲屋尘螨 (*Dermatophagoides farinae*)、革螨属 (*Dermacentor* spp.)、始叶螨属 (*Eotetranychus* spp.) (例如核桃始叶螨 (*Eotetranychus hicoriae*))、梨上瘿螨 (*Epitrimerus pyri*)、真叶螨属 (*Eutetranychus* spp.) (例如班氏真叶螨 (*Eutetranychus banksi*))、瘿螨属 (*Eriophyes* spp.) (例如梨瘿螨 (*Eriophyes pyri*))、家甜食螨 (*Glycyphagus domesticus*)、红足海镰螯螨 (*Halotydeus destructor*)、半跗线螨属 (*Hemitarsonemus* spp.) (例如茶半跗线螨 (*Hemitarsonemus latus*) (=侧多食跗线螨 (*Polyphagotarsonemus latus*)))、璃眼蜱属 (*Hyalomma* spp.)、硬蜱属 (*Ixodes* spp.)、毒蛛属 (*Latrodectus* spp.)、斜蛛属 (*Loxosceles* spp.)、秋收恙螨 (*Neutrombicula autumnalis*)、Nuphersa属、小爪螨属 (*Oligonychus* spp.) (例如咖啡小爪螨 (*Oligonychus coffeae*)、*Oligonychus coniferarum*、冬青小爪螨 (*Oligonychus ilicis*)、甘蔗小爪螨 (*Oligonychus indicus*)、芒果小爪螨 (*Oligonychus mangiferus*)、草地小爪螨 (*Oligonychus pratensis*)、石榴小爪螨 (*Oligonychus punicae*)、樟小爪螨 (*Oligonychus yothersi*))、钝缘蜱属 (*Ornithodoros* spp.)、禽刺螨属 (*Ornithonyssus* spp.)、全爪螨属 (*Panonychus* spp.) (例如柑桔全爪螨 (*Panonychus citri* (=Metatetranychus citri))、苹果全爪螨 (*Panonychus ulmi* (=Metatetranychus ulmi)))、柑桔锈螨 (*Phyllocoptruta oleivora*)、多趾宽叶螨 (*Platytetranychus multidigituli*)、侧多食跗线螨 (*Polyphagotarsonemus latus*)、痒螨属 (*Psoroptes* spp.)、扇头蜱属 (*Rhipicephalus* spp.)、根螨属 (*Rhizoglyphus* spp.)、疥螨属 (*Sarcoptes* spp.)、中东金蝎 (*Scorpio maurus*)、狭跗线螨种 (*Stenotarsonemus* spp.)、稻细螨 (*Steneotarsonemus spinki*)、跗线螨属 (*Tarsonemus* spp.) (例如乱跗线螨 (*Tarsonemus confusus*)、樱草狭跗线螨 (*Tarsonemus pallidus*))、叶螨属 (*Tetranychus* spp.) (例如加拿大叶螨 (*Tetranychus canadensis*)、朱砂叶螨 (*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、番茄斜背瘤瘿螨 (*Vasates lycopersici*);

[0167] 唇足纲 (*Chilopoda*) 的害虫, 例如, 地蜈蚣属 (*Geophilus* spp.)、蚰蜒属 (*Scutigera* spp.);

[0168] 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*);

[0169] 倍足纲 (*Diplopoda*) 的害虫, 例如, 千足虫 (*Blaniulus guttulatus*);

[0170] 昆虫纲的害虫, 例如蜚蠊目 (*Blattodea*), 如东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*)、亚洲蜚蠊 (*Blattella asahinai*)、德国小蠊 (*Blattella germanica*)、马德拉蜚蠊 (*Leucophaea maderae*)、*Loboptera decipiens*、家屋斑蠊 (*Neostylopyga rhombifolia*)、古巴蠊属 (*Panchlora* spp.)、木蠊属 (*Parcoblatta* spp.)、大蠊属 (*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*);

[0171] 鞘翅目 (*Coleoptera*) 的害虫, 例如, 条纹南瓜甲 (*Acalymma vittatum*)、菜豆象 (*Acanthoscelides obtectus*)、喙丽金龟属 (*Adoretus* spp.)、小蜂窝甲虫 (*Aethina tumida*)、杨树萤叶甲 (*Agelastica alni*)、叩甲属 (*Agriotes* spp.) (例如直条叩头虫

(*Agriotes linneatus*)、小麦叩头虫(*Agriotes mancus*)、黑菌虫(*Alphitobius diaperinus*)、马铃薯鳃角金龟(*Amphimallon solstitialis*)、家具窃蠹(*Anobium punctatum*)、星天牛属(*Anoplophora* spp.)、花象属(*Anthonomus* spp.) (例如棉铃象甲(*Anthonomus grandis*))、圆皮蠹属(*Anthrenus* spp.)、梨象属(*Apion* spp.)、阿鳃金龟属(*Apogonia* spp.)、隐食甲属(*Atomaria* spp.) (例如甜菜隐食甲(*Atomaria linearis*))、毛皮蠹属(*Attagenus* spp.)、*Baris caerulescens*、恶条豆象(*Bruchidius obtectus*)、豆象属(*Bruchus* spp.) (例如豌豆象(*Bruchus pisorum*)、蚕豆象(*Bruchus rufimanus*))、龟叶甲属(*Cassida* spp.)、菜豆莹叶甲(*Cerotoma trifurcata*)、龟象属(*Ceuthorhynchus* spp.) (例如白菜籽龟象(*Ceutorrhynchus assimilis*)、甘蓝茎龟象(*Ceutorrhynchus quadridens*)、白菜龟象(*Ceutorrhynchus rapae*))、跳甲属(*Chaetocnema* spp.) (例如甘薯跳甲(*Chaetocnema confinis*)、玉米齿叶甲(*Chaetocnema denticulata*)、玉米跳甲(*Chaetocnema ectypa*)、方喙象属(*Cleonus mendicus*)、宽胸叩头虫属(*Conoderus* spp.)、根颈象属(*Cosmopolites* spp.) (例如香蕉根颈象(*Cosmopolites sordidus*))、褐新西兰肋翅鳃角金龟(*Costelytra zealandica*)、叩甲属(*Ctenicera* spp.)、象虫属(*Curculio* spp.) (例如美核桃象(*Curculio caryae*)、大栗象(*Curculio caryatrypes*)、美洲榛子象(*Curculio obtusus*)、小栗象(*Curculio sayi*))、锈赤扁谷盗(*Cryptolestes ferrugineus*)、长角扁谷盗(*Cryptolestes pusillus*)、杨干隐喙象(*Cryptorhynchus lapathi*)、芒果果核象甲(*Cryptorhynchus mangiferae*)、细枝象属(*Cylindrocopturus* spp.)、密点细枝象(*Cylindrocopturus adspersus*)、洋松细枝象(*Cylindrocopturus furnissi*)、皮蠹属(*Dermestes* spp.)、叶甲属(*Diabrotica* spp.) (例如黄瓜条叶甲(*Diabrotica balteata*)、北方玉米根甲(*Diabrotica barberi*)、南方十一星瓜叶甲(*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、十一星叶甲食根亚虫(*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*)、西部玉米根虫(*Diabrotica virgifera virgifera*)、墨西哥玉米根虫(*Diabrotica virgifera zea*))、蛀野螟属(*Dichocrocis* spp.)、水稻铁甲(*Dicladispa armigera*)、*Diloboderus*属、*Epicaerus*属、食植瓢虫属(*Epilachna* spp.) (例如南瓜瓢虫(*Epilachna borealis*)、墨西哥豆瓢虫(*Epilachna varivestis*))、毛跳甲属(*Epitrix* spp.) (例如黄瓜跳甲(*Epitrix cucumeris*)、茄子跳甲(*Epitrix fuscula*)、烟草跳甲(*Epitrix hirtipennis*)、美国马铃薯跳甲(*Epitrix subcrinita*)、块茎跳甲(*Epitrix tuberis*))、钻孔虫属(*Faustinus* spp.)、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(*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(*Hypothenemus* spp.) (例如咖啡果小蠹(*Hypothenemus hampei*)、苹枝小囊(*Hypothenemus obscurus*)、毛竹小蠹(*Hypothenemus pubescens*))、甘蔗大褐齿爪鳃金龟(*Lachnosterna consanguinea*)、烟草甲(*Lasioderma serricorne*)、长头谷盗(*Latheticus oryzae*)、波缘薪甲属(*Lathridius* spp.)、负泥虫属(*Lema* spp.)、马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata*)、潜叶蛾属(*Leucoptera* spp.) (例如咖啡潜叶蛾(*Leucoptera coffeella*))、稻根象(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、象甲属种(*Listronotus* (= *Hyperodes*) spp.)、筒喙象属(*Lixus* spp.)、*Luperodes*属种、黄胸寡毛跳

甲 (*Luperomorpha xanthodera*)、粉蠹属 (*Lyctus* spp.)、美洲叶甲属 (*Megascelis* spp.)、梳爪叩头虫属 (*Melanotus* spp.) (例如 *Melanotus longulus oregonensis*)、油菜花露尾甲 (*Meligethes aeneus*)、鳃金龟属 (*Melolontha* spp.) (例如欧洲鳃金龟 (*Melolontha melolontha*))、*Migdolus* 属种、墨天牛属 (*Monochamus* spp.)、象甲 (*Naupactus xanthographus*)、隐跗郭公虫属 (*Necrobia* spp.)、*Neogalerucella* 属种、黄蛛甲 (*Niptus hololeucus*)、椰蛀犀金龟 (*Oryctes rhinoceros*)、锯谷盗 (*Oryzaephilus surinamensis*)、*Oryzaphagus oryzae*、耳象属 (*Otiorrhynchus* spp.) (例如苹果耳喙象 (*Otiorrhynchus cribricollis*)、苜蓿耳喙象 (*Otiorrhynchus ligustici*)、草莓耳喙象 (*Otiorrhynchus ovatus*)、粗糙草莓耳喙象 (*Otiorrhynchus rugosostriatus*)、黑葡萄耳喙象 (*Otiorrhynchus sulcatus*))、负泥虫属 (*Oulema* spp.) (例如橙足负泥虫 (*Oulema melanopus*)、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 (*Phyllophaga* spp.)、鳃金龟 (*Phyllophaga helleri*)、黄条跳甲属 (*Phyllotreta* spp.) (例如辣根条跳甲 (*Phyllotreta armoraciae*)、西方黑跳甲 (*Phyllotreta pusilla*)、美条纹跳甲 (*Phyllotreta ramosa*)、黄曲条跳甲 (*Phyllotreta striolata*))、日本弧丽金龟 (*Popillia japonica*)、象甲属 (*Premnotrypes* spp.)、大谷蠹 (*Prostephanus truncatus*)、跳甲属 (*Psylliodes* spp.) (例如马铃薯跳甲 (*Psylliodes affinis*)、油菜金头跳甲 (*Psylliodes chrysocephala*)、忽布跳甲 (*Psylliodes punctulata*))、蛛甲属 (*Ptinus* spp.)、暗色瓢虫 (*Rhizobius ventralis*)、谷蠹 (*Rhizopertha dominica*)、隐喙象属 (*Rhynchophorus* spp.)、红棕象甲 (*Rhynchophorus ferrugineus*)、棕榈象甲 (*Rhynchophorus palmarum*)、侧突双棘长蠹 (*Sinoxylon perforans*)、谷象属 (*Sitophilus* spp.) (例如谷象 (*Sitophilus granarius*)、罗望子象 (*Sitophilus linearis*)、米象 (*Sitophilus oryzae*)、玉米象 (*Sitophilus zeamais*))、尖隐喙象属 (*Sphenophorus* spp.)、药材甲 (*Stegobium paniceum*)、茎干象属 (*Sternechus* spp.) (例如豆茎象 (*Sternechus paludatus*))、宽幅天牛属 (*Symphyletes* spp.)、纤毛象属 (*Tanymecus* spp.) (例如双宽隆突纤毛象 (*Tanymecus dilaticollis*)、印度纤毛象 (*Tanymecus indicus*)、甜菜灰象甲 (*Tanymecus palliatus*)、黄粉虫 (*Tenebrio molitor*)、大谷盗 (*Tenebrioides mauretanicus*)、拟谷盗属 (*Tribolium* spp.) (例如美洲黑拟谷盗 (*Tribolium audax*)、赤拟谷盗 (*Tribolium castaneum*)、杂拟谷盗 (*Tribolium confusum*))、斑皮蠹属 (*Trogoderma* spp.)、籽象属 (*Tychius* spp.)、脊虎天牛属 (*Xylotrechus* spp.)、距步甲属 (*Zabrus* spp.) (例如玉米距步甲 (*Zabrus tenebrioides*))；

[0172] 革翅目 (*Dermaptera*) 的害虫, 例如, 海岸肥螽 (*Anisolabis maritime*)、欧洲球螽 (*Forficula auricularia*)、溪岸螽螋 (*Labidura riparia*)；

[0173] 双翅目 (*Diptera*) 的害虫, 例如, 伊蚊属 (*Aedes* spp.) (例如埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*)、白纹伊蚊 (*Aedes albopictus*)、叮刺伊蚊 (*Aedes sticticus*)、骚扰伊蚊 (*Aedes vexans*))、潜蝇属 (*Agromyza* spp.) (例如苜蓿斑潜蝇 (*Agromyza frontella*)、美洲黍潜蝇 (*Agromyza parvicornis*))、按实蝇属 (*Anastrepha* spp.)、按蚊属 (*Anopheles* spp.) (例如四斑按蚊 (*Anopheles quadrimaculatus*)、冈比亚按蚊 (*Anopheles gambiae*))、瘿蚊属 (*Asphondylia* spp.)、果实蝇属 (*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*)、天青丽蝇 (*Calliphora erythrocephala*)、红头丽蝇 (*Calliphora vicina*)、地中海实蝇 (*Ceratitis capitata*)、摇蚊属 (*Chironomus* spp.)、金蝇属 (*Chrysomya* spp.)、斑虻属 (*Chrysops* spp.)、高额麻虻 (*Chrysozona pluvialis*)、锥蝇属 (*Cochliomya* spp.)、康瘿蚊属 (*Contarinia* spp.) (例如葡萄瘿蚊 (*Contarinia johnsoni*)、甘蓝瘿蚊 (*Contarinia nasturtii*)、梨实康瘿蚊 (*Contarinia pyrivora*)、向日葵瘿蚊 (*Contarinia schulzi*)、高粱康瘿蚊 (*Contarinia sorghicola*)、麦黄康瘿蚊 (*Contarinia tritici*))、人皮蝇 (*Cordylobia anthropophaga*)、环足摇蚊 (*Cricotopus sylvestris*)、库蚊属 (*Culex* spp.) (例如尖音库蚊 (*Culex pipiens*)、致倦库蚊 (*Culex quinquefasciatus*))、库蠓属 (*Culicoides* spp.)、脉毛蚊属 (*Culiseta* spp.)、黄蝇属 (*Cuterebra* spp.)、橄榄大实蝇 (*Dacus oleae*)、叶瘿蚊属 (*Dasyneura* spp.) (例如油菜叶瘿蚊 (*Dasineura brassicae*))、地种蝇属 (*Delia* spp.) (例如葱地种蝇 (*Delia antiqua*)、麦地种蝇 (*Delia coarctata*)、毛跗地种蝇 (*Delia florilega*)、灰地种蝇 (*Delia platura*)、甘蓝地种蝇 (*Delia radicum*))、人肤蝇 (*Dermatobia hominis*)、果蝇属 (*Drosophila* spp.) (例如黑腹果蝇 (*Drosophila melanogaster*)、樱桃果蝇 (*Drosophila suzukii*))、稻象属 (*Echinocnemus* spp.)、*Euleia heraclei*、厕蝇属 (*Fannia* spp.)、胃蝇属 (*Gastrophilus* spp.)、舌蝇属 (*Glossina* spp.)、麻虻属 (*Haematopota* spp.)、毛眼水蝇属 (*Hydrellia* spp.)、大麦毛眼水蝇 (*Hydrellia griseola*)、种蝇属 (*Hylemya* spp.)、虱蝇属 (*Hippobosca* spp.)、皮蝇属 (*Hypoderma* spp.)、斑潜蝇属 (*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 (*Lucilia* spp.) (例如铜绿蝇 (*Lucilia cuprina*))、罗蛉属 (*Lutzomyia* spp.)、曼蚊属 (*Mansonia* spp.)、家蝇属 (*Musca* spp.) (例如家蝇 (*Musca domestica*)、舍蝇 (*Musca domestica vicina*))、狂蝇属 (*Oestrus* spp.)、瑞典麦秆蝇 (*Oscinella frit*)、拟长跑摇蚊属 (*Paratanytarsus* spp.)、*Paralauterborniella subcincta*、泉蝇属 (*Pegomya* 或 *Pegomyia* spp.) (例如甜菜泉蝇 (*Pegomya betae*)、天仙子泉蝇 (*Pegomya hyoscyami*)、悬钩子泉蝇 (*Pegomya rubivora*))、白蛉属 (*Phlebotomus* spp.)、草种蝇属 (*Phorbia* spp.)、伏蝇属 (*Phormia* spp.)、酪蝇 (*Piophilus casei*)、芦笋实蝇 (*Platyparea poeciloptera*)、*Prodiplosis* 属种、胡萝卜茎蝇 (*Psila rosae*)、绕实蝇属 (*Rhagoletis* spp.) (例如樱桃绕实蝇 (*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 (*Sarcophaga* spp.)、蚋属 (*Simulium* spp.) (例如南方蚋 (*Simulium meridionale*))、螯蝇属 (*Stomoxys* spp.)、虻属 (*Tabanus* spp.)、根斑蝇属 (*Tetanops* spp.)、大蚊属 (*Tipula* spp.) (例如欧洲大蚊 (*Tipula paludosa*)、牧场大蚊 (*Tipula simplex*))、番木瓜长尾实蝇 (*Toxotrypana curvicauda*)；

[0174] 半翅目 (*Hemiptera*) 的害虫, 例如 *Acizzia acaciaebaileyanae*、*Acizzia dodonaeae*、木虱 (*Acizzia uncatoides*)、长头蝗 (*Acrida turrita*)、无网长管蚜属 (*Acyrtosiphon* spp.) (例如豌豆长管蚜 (*Acyrtosiphon pisum*))、*Acrogonia* 属种、*Aeneolamia* 属种、隆脉木虱属 (*Agonosцена* spp.)、刺粉虱属 (*Aleurocanthus* spp.)、欧洲

甘蓝粉虱 (*Aleyrodes proletella*)、甘蔗穴粉虱 (*Aleurolobus barodensis*)、棉粉虱 (*Aleurothrixus floccosus*)、植莲木虱 (*Allocaridara malayensis*)、芒果叶蝉属 (*Amrasca* spp.) (例如小绿叶蝉 (*Amrasca bigutulla*)、小叶蝉 (*Amrasca devastans*))、飞廉短尾蚜 (*Anuraphis cardui*)、肾圆盾蚧属 (*Aonidiella* spp.) (例如红肾圆盾蚧 (*Aonidiella aurantii*)、黄肾圆盾蚧 (*Aonidiella citrina*)、苏铁肾盾蚧 (*Aonidiella inornata*))、梨瘤蚜 (*Aphanostigma piri*)、蚜属 (*Aphis* spp) (例如绣线菊蚜 (*Aphis citricola*)、黑豆蚜 (*Aphis craccivora*)、甜菜蚜 (*Aphis fabae*)、草莓根蚜 (*Aphis forbesi*)、大豆蚜 (*Aphis glycines*)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)、常春藤蚜 (*Aphis hederæ*)、葡萄藤蚜 (*Aphis illinoisensis*)、*Aphis middletoni*、鼠李马铃薯蚜 (*Aphis nasturtii*)、夹竹桃蚜 (*Aphis nerii*)、苹果蚜 (*Aphis pomi*)、卷叶蚜 (*Aphis spiraeicola*)、*Aphis viburniphila*)、葡萄叶蜂 (*Arboridia apicalis*)、*Arytainilla*属种、小圆盾蚧属 (*Aspidiella* spp.)、圆盾蚧属 (*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*)、澳大利亚木虱 (*Blastopsylla occidentalis*)、*Boreioglycaspis melaleucae*、李短尾蚜 (*Brachycaudus helichrysi*)、微管蚜属 (*Brachycolus* spp.)、甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*)、喀木虱属 (*Cacopsylla* spp.) (例如梨木虱 (*Cacopsylla pyricola*))、小褐稻虱 (*Calligypona marginata*)、*Capulinia*属种、丽黄头大叶蝉 (*Carneocephala fulgida*)、甘蔗绵蚜 (*Ceratovacuna lanigera*)、沫蝉科 (*Cercopidae*)、蜡蚧属 (*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*)、褐圆蚧 (*Chrysomphalus aonidum*)、黑褐圆盾蚧 (*Chrysomphalus ficus*)、玉米叶蝉 (*Cicadulina mbila*)、*Cocco-mytilus halli*、软蚧属 (*Coccus* spp.) (例如褐软蚧 (*Coccus hesperidum*)、长椭圆软蚧 (*Coccus longulus*)、橘软蜡蚧 (*Coccus pseudomagnoliarum*)、咖啡绿软蚧 (*Coccus viridis*))、隐瘤蚜 (*Cryptomyzus ribis*)、*Cryptoneossa*属种、梳木虱属 (*Ctenarytaina* spp.)、黄翅叶蝶属 (*Dalbulus* spp.)、*Dialeurodes chittendeni*、柑橘粉虱 (*Dialeurodes citri*)、柑橘木虱 (*Diaphorina citri*)、白背盾蚧属 (*Diaspis* spp.)、*Diuraphis*属种、*Doralis*属种、履绵蚧属 (*Drosicha* spp.)、西圆尾蚜属 (*Dysaphis* spp.) (例如锈条蚜 (*Dysaphis apiifolia*)、车前圆尾蚜 (*Dysaphis plantaginea*)、百合西圆尾蚜 (*Dysaphis tulipae*))、灰粉蚧属 (*Dysmicoccus* spp.)、小绿叶蝉属 (*Empoasca* spp.) (例如西部马铃薯叶蝉 (*Empoasca abrupta*)、马铃薯微叶蝉 (*Empoasca fabae*)、苹果小绿叶蝉 (*Empoasca maligna*)、茄微叶蝉 (*Empoasca solana*)、*Empoasca stevensi*)、绵蚜属 (*Eriosoma* spp.) (例如美洲绵蚜 (*Eriosoma americanum*)、苹果绵蚜 (*Eriosoma lanigerum*)、梨根绵蚜 (*Eriosoma pyricola*))、斑叶蝉属 (*Erythroneura* spp.)、*Eucalyptolyma*属种、褐木虱属 (*Euphyllura* spp.)、殃叶蝉 (*Euscelis bilobatus*)、拂粉阶属 (*Ferrisia* spp.)、*Fiorinia*属种、*Furcaspis oceanica*、咖啡地粉蚧 (*Geococcus coffeae*)、*Glycaspis*属种、银合欢木虱 (*Heteropsylla cubana*)、颊木虱 (*Heteropsylla spinulosa*)、假桃病毒叶蝉 (*Homalodisca coagulata*)、梅大尾蚜 (*Hyalopterus arundinis*)、桃大尾蚜 (*Hyalopterus pruni*)、吹绵蚧属 (*Icerya* spp.) (例如吹绵蚧 (*Icerya purchasi*))、片角叶蝉属 (*Idiocerus* spp.)、扁喙叶蝉属 (*Idioscopus*

spp.)、灰飞虱(*Laodelphax striatellus*)、蜡蚧属(*Lecanium* spp.) (例如水土坚蚧(*Lecanium corni*) (= *Parthenolecanium corni*))、盾蚧属(*Lepidosaphes* spp.) (例如榆蚧盾蚧(*Lepidosaphes ulmi*))、萝卜蚜(*Lipaphis erysimi*)、日本长白蚧(*Lopholeucaspis japonica*)、斑衣蜡蝉(*Lycorma delicatula*)、长管蚜属(*Macrosiphum* spp.) (例如马铃薯长管蚜(*Macrosiphum euphorbiae*)、百合长管蚜(*Macrosiphum lilii*)、蔷薇长管蚜(*Macrosiphum rosae*))、二点叶蜂(*Macrosteles facifrons*)、沫蝶属(*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(*Myzus* spp.) (例如冬葱瘤蚜(*Myzus ascalonicus*)、梅瘤蚜(*Myzus cerasi*)、女贞瘤蚜(*Myzus ligustri*)、莴菜瘤蚜(*Myzus ornatus*)、桃蚜(*Myzus persicae*)、烟蚜(*Myzus nicotianae*))、莴苣衲长管蚜(*Nasonovia ribisnigri*)、新马氏粉虱属(*Neomaskellia* spp.)、黑尾叶蝉属(*Nephotettix* spp.) (例如黑尾叶蝉(*Nephotettix cincticeps*)、二条黑尾叶蝉(*Nephotettix nigropictus*))、*Nettigonella spectra*、褐飞虱(*Nilaparvata lugens*)、*Oncometopia*属种、*Orthezia praelonga*、中华稻蝗(*Oxya chinensis*)、*Pachypsylla*属种、杨梅粉虱(*Parabemisia myricae*)、木虱属(*Paratrioza* spp.) (例如马铃薯木虱(*Paratrioza cockerelli*))、片盾蚧属(*Parlatoria* spp.)、瘿绵蚜属(*Pemphigus* spp.) (例如囊柄瘿绵蚜(*Pemphigus bursarius*)、*Pemphigus populivenae*)、玉米蜡蝉(*Peregrinus maidis*)、扁角飞虱属(*Perkinsiella* spp.)、绵粉蚧属(*Phenacoccus* spp.) (例如美地绵粉蚧(*Phenacoccus madeirensis*))、杨平翅绵蚜(*Phloeomyzus passerinii*)、忽布疣蚜(*Phorodon humuli*)、葡萄根瘤蚜属(*Phylloxera* spp.) (例如*Phylloxera devastatrix*、警根瘤蚜(*Phylloxera notabilis*))、苏铁褐点并盾蚧(*Pinnaspis aspidistrae*)、臀纹粉蚧属(*Planococcus* spp.) (例如橘臀纹粉蚧(*Planococcus citri*))、*Prosopidopsylla flava*、梨形原绵腊蚧(*Protopulvinaria pyriformis*)、桑白盾蚧(*Pseudaulacaspis pentagona*)、粉蚧属(*Pseudococcus* spp.) (例如柑栖粉蚧(*Pseudococcus calceolariae*)、康氏粉蚧(*Pseudococcus comstocki*)、拟长尾粉蚧(*Pseudococcus longispinus*)、葡萄粉蚧(*Pseudococcus maritimus*)、暗色粉蚧(*Pseudococcus viburni*))、*Psyllopsis* spp.、木虱属(*Psylla* spp.) (例如黄杨木虱(*Psylla buxi*)、苹果木虱(*Psylla mali*)、梨木虱(*Psylla pyri*))、金小蜂属(*Pteromalus* spp.)、桃绵蜡蚧(*Pulvinaria* spp.)、*Pyrilla* spp.、笠圆盾蚧属(*Quadraspidotus* spp.) (例如胡桃园盾蚧(*Quadraspidotus juglansregiae*)、杨笠圆盾蚧(*Quadraspidotus ostreaeformis*)、梨笠盾蚧(*Quadraspidotus perniciosus*))、*Quesada gigas*、平刺粉蚧属(*Rastrococcus* spp.)、缢管蚜属(*Rhopalosiphum* spp.) (例如玉米蚜(*Rhopalosiphum maidis*)、苹草缢管蚜(*Rhopalosiphum oxyacanthae*)、禾谷缢管蚜(*Rhopalosiphum padi*)、红腹缢管蚜(*Rhopalosiphum rufiabdominale*))、黑盔蚧属(*Saissetia* spp.) (例如咖啡黑盔蚧(*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(*Selenaspis articulatus*)、*Sipha flava*、麦长管蚜(*Sitobion avenae*)、长唇基飞虱属(*Sogata* spp.)、白背飞虱(*Sogatella furcifera*)、稻飞虱属(*Sogatodes* spp.)、三角碟(*Stictocephala festina*)、树粉虱(*Siphoninus*

phillyreae)、Tenalaphara malayensis、Tetragonocephela spp.、美洲山核桃长斑蚜 (Tinocallis caryaefoliae)、广胸沫蝉属 (Tomaspis spp.)、声蚜属 (Toxoptera spp.) (例如小桔蚜 (Toxoptera aurantii)、大桔蚜 (Toxoptera citricidus))、温室粉虱 (Trialeurodes vaporariorum)、尖翅木虱属 (Trioza spp.) (例如柿木虱 (Trioza diospyri))、小叶蝉属 (Typhlocyba spp.)、尖盾蚧属 (Unaspis spp.)、葡萄根瘤蚜 (Viteus vitifolii)、么叶蝉属 (Zygina spp.)；

[0175] 异翅目 (Heteroptera) 的害虫, 例如, 麦蝽属 (Aelia spp.)、南瓜缘蝽 (Anasa tristis)、拟丽蝽属 (Antestiopsis spp.)、Boisea 属种、土长蝽属 (Blissus spp.)、俊盲蝽属 (Calocoris spp.)、斑腿微刺盲蝽 (Campylomma livida)、异背长蝽属 (Cavelerius spp.)、臭虫属 (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 (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 (Dysdercus spp.)、美洲蝽属 (Euschistus spp.) (例如英雄美洲蝽 (Euschistus heros)、褐美洲蝽 (Euschistus servus)、三色美洲蝽 (Euschistus tristigma)、广斑美洲蝽 (Euschistus variolarius))、菜蝽属 (Eurydema spp.)、扁盾蝽属 (Eurygaster spp.)、茶翅蝽 (Halyomorpha halys)、盲蝽属 (Heliopeltis spp.)、Horcias nobilellus、稻缘蝽属 (Leptocorisa spp.)、异稻缘蝽 (Leptocorisa varicornis)、西部喙缘蝽 (Leptoglossus occidentalis)、叶缘缘蝽 (Leptoglossus phyllopus)、丽盲蝽属 (Lygocoris spp.) (例如原丽盲蝽 (Lygocoris pabulinus))、草盲蝽属 (Lygus spp.) (例如灰豆草盲蝽 (Lygus elisus)、豆荚草盲蝽 (Lygus hesperus)、美国牧草盲蝽 (Lygus lineolaris))、蔗黑长蝽 (Macropes excavatus)、筛豆龟蝽 (Megacopta cribraria)、盲蝽 (Miridae)、黑摩盲蝽 (Monalonia atratum)、绿蝽属 (Nezara spp.) (例如稻绿蝽 (Nezara viridula))、小长蝽属 (Nysius spp.)、稻蝽属 (Oebalus spp.)、Pentomidae、方背皮蝽 (Piesma quadrata)、壁蝽属 (Piezodorus spp.) (例如盖德拟壁蝽 (Piezodorus guildinii))、盲蝽属 (Psallus spp.)、Pseudacysta perseae、红猎蝽属 (Rhodnius spp.)、可可褐盲蝽 (Sahlbergella singularis)、Scaptocoris castanea、黑蝽属

[0176] (Scotinophora spp.)、梨冠网蝽 (Stephanitis nashi)、Tibraca spp.、锥

[0177] 猎蝽属 (Triatoma spp.)；

[0178] 膜翅目 (Hymenoptera) 的害虫, 例如, 顶切叶蚁属 (Acromyrmex spp.)、菜叶蜂属 (Athalia spp.) (例如 z.B. 黄翅菜叶蜂 (z.B. Athalia rosae))、切叶蚁属 (Atta spp.)、弓背蚁属 (Camponotus spp.)、长黄胡蜂属 (Dolichovespula spp.)、松叶蜂属 (Diprion spp.) (例如类欧松叶蜂 (Diprion similis))、实叶蜂属 (Hoplocampa spp.) (例如樱实叶蜂 (Hoplocampa cookei)、苹叶蜂 (Hoplocampa testudinea))、毛蚁属 (Lasius spp.)、阿根廷蚁 (Linepithema (Iridomyrmex) humile)、小家蚁 (Monomorium pharaonis)、立毛蚁属 (Paratrechina spp.)、Paravespula 属种、斜结蚁属 (Plagiolepis spp.)、树蜂属 (Sirex spp.)、红火蚁 (Solenopsis invicta)、臭蚁属 (Tapinoma spp.)、白足狡臭蚁 (Technomyrmex albipes)、树蜂属 (Urocerus spp.)、胡蜂属 (Vespa spp.) (例如黄边胡蜂 (Vespa crabro))、小火蚁 (Wasmannia auropunctata)、黑树蜂属 (Xeris spp.)；

[0179] 等足目 (Isopoda) 的害虫, 例如, 鼠妇 (*Armadillidium vulgare*)、栉水虱 (*Oniscus asellus*)、球鼠妇 (*Porcellio scaber*);

[0180] 等翅目 (Isoptera) 的害虫, 例如, 家白蚁属 (*Coptotermes* spp.) (例如台湾乳白蚁 (*Coptotermes formosanus*))、堆角白蚁 (*Cornitermes cumulans*)、堆砂白蚁属 (*Cryptotermes* spp.)、楹白蚁属 (*Incisitermes* spp.)、木白蚁属 (*Kaloterme* spp.)、稻麦小白蚁 (*Microtermes obesi*)、象白蚁属 (*Nasutitermes* spp.)、土白蚁属 (*Odontotermes* spp.)、洞白蚁属 (*Porotermes* spp.)、散白蚁属 (*Reticulitermes* spp.) (例如黄肢散白蚁 (*Reticulitermes flavipes*)、西方散白蚁 (*Reticulitermes hesperus*));

[0181] 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 (*Adoxophyes* spp.) (例如棉褐带卷蛾 (*Adoxophyes orana*))、烦夜蛾 (*Aedia leucomelas*)、地老虎属 (*Agrotis* spp.) (例如黄地老虎 (*Agrotis segetum*)、小地老虎 (*Agrotis ipsilon*))、波纹夜蛾属 (*Alabama* spp.) (例如棉叶波纹夜蛾 (*Alabama argillacea*))、脐橙螟蛾 (*Amyelois transitella*)、条麦蛾属 (*Anarsia* spp.)、干煞夜蛾属 (*Anticarsia* spp.) (例如大豆夜蛾 (*Anticarsia gemmatalis*))、条小卷蛾属 (*Argyroplote* spp.)、丫蚊夜蛾属 (*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 (*Busseola* spp.)、卷叶蛾属 (*Cacoecia* spp.)、茶细蛾 (*Caloptilia theivora*)、烟卷蛾 (*Capua reticulana*)、苹果小卷蛾 (*Carpocapsa pomonella*)、桃蛀果蛾 (*Carposina niponensis*)、冬尺蛾 (*Cheimatobia brumata*)、禾草螟属 (*Chilo* spp.) (例如 *Chilo plejadellus*、二化螟 (*Chilo suppressalis*))、苹果舞蛾 (*Choreutis pariana*)、色卷蛾属 (*Choristoneura* spp.)、裸蚊夜蛾 (*Chrysodeixis chalcites*)、葡萄果蠹蛾 (*Clysia ambiguella*)、纵卷叶野螟属 (*Cnaphalocerus* spp.)、稻纵卷叶野螟 (*Cnaphalocrocis medinalis*)、云卷蛾属 (*Cnephasia* spp.)、茶枝尖细蛾属 (*Conopomorpha* spp.)、球颈象属 (*Conotrachelus* spp.)、*Copitarsia* 属种、小卷蛾属 (*Cydia* spp.) (例如豆荚小卷蛾 (*Cydia nigricana*)、苹果蠹蛾 (*Cydia pomonella*))、*Dalaca noctuides*、绢野螟属 (*Diaphania* spp.)、*Diparopsis* 属种、小蔗杆草螟 (*Diatraea saccharalis*)、钻夜蛾属 (*Earias* spp.)、*Ecdytolopha aurantium*、南美玉米苗斑螟 (*Elasmopalpus lignosellus*)、非洲蔗螟 (*Eldana saccharina*)、粉斑螟属 (*Ephestia* spp.) (例如烟草粉斑螟 (*Ephestia elutella*)、地中海斑螟 (*Ephestia kuehniella*))、叶小卷蛾属 (*Epinotia* spp.)、苹淡褐卷蛾 (*Epiphyas postvittana*)、落叶松尺蛾属 (*Erannis* spp.)、亚洲胡桃蛾 (*Erschoviella musculana*)、莢斑螟属 (*Etiella* spp.)、艳叶蛾属 (*Eudocima* spp.)、棕卷蛾属 (*Eulia* spp.)、女贞细卷蛾 (*Eupoecilia ambiguella*)、毒蛾属 (*Euproctis* spp.) (例如黄毒蛾 (*Euproctis chrysorrhoea*))、切夜蛾属 (*Euxoa* spp.)、脏切夜蛾属 (*Feltia* spp.)、大蜡螟 (*Galleria mellonella*)、细蛾属 (*Gracillaria* spp.)、小食心虫属 (*Grapholitha* spp.) (例如梨小食心虫 (*Grapholitha molesta*)、杏小食心虫 (*Grapholitha prunivora*))、甘蔗螟属 (*Hedylepta* spp.)、铃夜蛾属 (*Helicoverpa* spp.) (例如棉铃虫 (*Helicoverpa armigera*)、玉米穗虫 (*Helicoverpa zea*))、实夜蛾属 (*Heliothis* spp.) (例如烟芽夜蛾 (*Heliothis virescens*))、褐织蛾 (*Hofmannophila pseudospretella*)、同斑螟属 (*Homoeosoma* spp.)、

长卷蛾属 (*Homona* spp.)、苹果巢蛾 (*Hyponomeuta padella*)、柿举枝蛾 (*Kakivoria flavofasciata*)、亮灰蝶属 (*Lampides* spp.)、贪夜蛾属 (*Laphygma* spp.)、蠹食心虫 (*Laspeyresia molesta*)、茄白翅野螟 (*Leucinodes orbonalis*)、潜叶蛾属 (*Leucoptera* spp.) (例如咖啡潜叶蛾 (*Leucoptera coffeella*))、潜叶细蛾属 (*Lithocolletis* spp.) (例如苹果斑幕潜叶蛾 (*Lithocolletis blancardella*))、绿果冬夜蛾 (*Lithophane antennata*)、花翅小卷蛾属 (*Lobesia* spp.) (例如葡萄花翅小卷蛾 (*Lobesia botrana*))、白缘豆夜蛾 (*Loxagrotis albicosta*)、毒蛾属 (*Lymantria* spp.) (例如舞毒蛾 (*Lymantria dispar*))、潜蛾属 (*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*)、稻暮眼蝶 (*Melanitis leda*)、毛胫夜蛾属 (*Mocis* spp.)、*Monopis obviella*、粘虫 (*Mythimna separata*)、橡长角蛾 (*Nemapogon cloacellus*)、水螟属 (*Nymphula* spp.)、*Oiketicus* 属种、楸属 (*Omphisa* spp.)、*Operophtera* 属种、麦秆夜蛾属 (*Oria* spp.)、瘤丛螟属 (*Orthaga* spp.)、秆野螟属 (*Ostrinia* spp.) (例如欧洲玉米螟 (*Ostrinia nubilalis*))、小眼夜蛾 (*Panolis flammea*)、稻弄蝶属 (*Parnara* spp.)、红铃虫属 (*Pectinophora* spp.) (例如棉红铃虫 (*Pectinophora gossypiella*))、潜跳甲属 (*Perileucoptera* spp.)、块茎蛾属 (*Phthorimaea* spp.) (例如马铃薯块茎蛾 (*Phthorimaea operculella*))、桔潜蛾 (*Phyllocnistis citrella*)、小潜细蛾属 (*Phyllonorycter* spp.) (例如金纹小潜细蛾 (*Phyllonorycter blancardella*)、山楂潜叶蛾 (*Phyllonorycter crataegella*))、粉蝶属 (*Pieris* spp.) (例如菜粉蝶 (*Pieris rapae*))、荷兰石竹小卷蛾 (*Platynota stultana*)、印度谷斑螟 (*Plodia interpunctella*)、金翅夜蛾属 (*Plusia* spp.)、菜蛾 (*Plutella xylostella*) (= 钻石背蛾 (*Plutella maculipennis*))、小白巢蛾属 (*Prays* spp.)、斜纹夜蛾属 (*Prodenia* spp.)、烟草天蛾属 (*Protoparce* spp.)、粘虫属 (*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 (*Schoenobius* spp.) (例如三化螟 (*Schoenobius bipunctifer*))、白禾螟属 (*Scirpophaga* spp.) (例如稻白螟 (*Scirpophaga innotata*))、黄地老虎 (*Scotia segetum*)、茎夜蛾属 (*Sesamia* spp.) (例如大螟 (*Sesamia inferens*))、长须卷蛾属 (*Sparganothis* spp.)、灰翅夜蛾属 (*Spodoptera* spp.) (例如 *Spodoptera eradiana*、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua*)、草地贪夜蛾 (*Spodoptera frugiperda*)、*Spodoptera praefica*)、展足蛾属 (*Stathmopoda* spp.)、*Stenoma* 属种、花生麦蛾 (*Stomopteryx subsecivella*)、透翅蛾属 (*Synanthedon* spp.)、安第斯马铃薯块茎蛾 (*Tecia solanivora*)、异舟蛾属 (*Thaumetopoea* spp.)、大豆夜蛾 (*Thermesia gemmatalis*)、木塞谷蛾 (*Tinea cloacella*)、袋谷蛾 (*Tinea pellionella*)、幕谷蛾 (*Tineola bisselliella*)、卷蛾属 (*Tortrix* spp.)、毛毡衣蛾 (*Trichophaga tapetzella*)、粉夜蛾属 (*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 (*Virachola* spp.)；

[0182] 直翅目 (*Orthoptera*) 或跳跃目 (*Saltatoria*) 的害虫，例如，家蟋蟀 (*Acheta domesticus*)、*Dichroplus* 属种、蝼蛄属 (*Gryllotalpa* spp.) (例如欧洲蝼蛄 (*Gryllotalpa gryllotalpa*))、蔗蝗属 (*Hieroglyphus* spp.)、飞蝗属 (*Locusta* spp.) (例如飞蝗 (*Locusta migratoria*))、黑蝗属 (*Melanoplus* spp.) (例如迁飞黑蝗 (*Melanoplus devastator*))、

Paratlanticus ussuriensis)、沙漠蝗(*Schistocerca gregaria*);

[0183] 虱目(Phthiraptera)的害虫,例如,例如畜虱属(*Damalinia* spp.)、血虱属(*Haematopinus* spp.)、毛虱属(*Linognathus* spp.)、虱属(*Pediculus* spp.)、根瘤蚜(*Phylloxera vastatrix*)、阴虱(*Ptirus pubis*)、啮毛虱属(*Trichodectes* spp.);

[0184] 啮虫目(Psocoptera)的害虫,例如,粉啮虫属(*Lepinatus* spp.)、书虱属(*Liposcelis* spp.);

[0185] 蚤目(Siphonaptera)的害虫,例如,角叶蚤属(*Ceratophyllus* spp.)、栉首蚤属(*Ctenocephalides* spp.) (例如犬栉头蚤(*Ctenocephalides canis*),猫栉首蚤(*Ctenocephalides felis*))、跳蚤(*Pulex irritans*)、穿皮潜蚤(*Tunga penetrans*)、印鼠客蚤(*Xenopsylla cheopis*);

[0186] 缨翅目(Thysanoptera)的害虫,例如,玉米黄呆蓟马(*Anaphothrips obscurus*)、稻蓟马(*Baliothrips biformis*)、*Chaetanaphothrips leeuweni*、葡萄镰蓟马(*Drepanothrips reuteri*)、*Enneothrips flavens*、花蓟马属(*Frankliniella* spp.) (例如烟褐蓟马(*Frankliniella fusca*)、西花蓟马(*Frankliniella occidentalis*)、苏花蓟马(*Frankliniella schultzei*)、麦花蓟马(*Frankliniella tritici*)、越桔花蓟马(*Frankliniella vaccinii*)、威廉斯花蓟马(*Frankliniella williamsi*))、蓟马属(*Haplothrips* spp.)、阳蓟马属(*Heliothrips* spp.)、温室条篱蓟马(*Hercinothrips femoralis*)、卡蓟马属(*Kakothrips* spp.)、葡萄蓟马(*Rhipiphorothrips cruentatus*)、硬蓟马属(*Scirtothrips* spp.)、小豆蓟带蓟马(*Taeniothrips cardamomi*)、蓟马属(*Thrips* spp.) (例如棕榈蓟马(*Thrips palmi*)、烟蓟马(*Thrips tabaci*));

[0187] 衣鱼目(*Zygentoma*) (= 缨尾目(*Thysanura*))的害虫,例如,栉衣鱼属(*Ctenolepisma* spp.)、衣鱼(*Lepisma saccharina*)、盗火虫(*Lepismodes inquilinus*)、家衣鱼(*Thermobia domestica*);

[0188] 综合纲(Symphyla)的害虫,例如,幺蚰属(*Scutigereilla* spp.) (例如无斑点幺蚰(*Scutigereilla immaculata*));

[0189] 软体动物门(Mollusca)的害虫,例如双壳纲(Bivalvia)的害虫,如饰贝属(*Dreissena* spp.),

[0190] 以及腹足纲(Gastropoda)的害虫,如阿勇蛞蝓属(*Arion* spp.) (例如黑红阿勇蛞蝓(*Arion ater rufus*))、双脐螺属(*Biomphalaria* spp.)、小泡螺属(*Bulinus* spp.)、野蛞蝓属(*Deroceras* spp.) (例如田灰蛞蝓(*Deroceras laeve*))、土蜗属(*Galba* spp.)、椎实螺属(*Lymnaea* spp.)、钉螺属(*Oncomelania* spp.)、福寿螺属(*Pomacea* spp.)、琥珀螺属(*Succinea* spp.);

[0191] 线虫纲(Nematoda)的植物害虫,即植物寄生线虫,尤其是野外垫刃线虫属(*Aglenchus* spp.) (例如居农野外垫刃线虫(*Aglenchus agricola*))、粒线虫属(*Anguina* spp.) (例如小麦粒线虫(*Anguina tritici*))、滑刃线虫属(*Aphelenchoides* spp.) (例如花生滑刃线虫(*Aphelenchoides arachidis*)、草莓滑刃线虫(*Aphelenchoides fragariae*))、刺线虫属(*Belonolaimus* spp.) (例如细小刺线虫(*Belonolaimus gracilis*)、长尾刺线虫(*Belonolaimus longicaudatus*)、诺顿刺线虫(*Belonolaimus nortoni*))、伞滑刃线虫属(*Bursaphelenchus* spp.) (例如椰子红环腐线虫(*Bursaphelenchus cocophilus*)、荒漠伞

滑刃线虫 (*Bursaphelenchus eremus*)、松材线虫 (*Bursaphelenchus xylophilus*)、坏死线虫属 (*Cacopaurus* spp.) (例如瘟疫坏死线虫 (*Cacopaurus pestis*))、小环线虫属 (*Criconemella* spp.) (例如弯曲小环线虫 (*Criconemella curvata*)、刻线小环线虫 (*Criconemella onoensis*)、装饰小环线虫 (*Criconemella ornata*)、畸形小环线虫 (*Criconemella rusium*)、薄叶小环线虫 (*Criconemella xenoplax* (= 环腐线虫 (*Mesocriconema xenoplax*)))、轮线虫属 (*Criconemoides* spp.) (例如弗尼亚轮线虫 (*Criconemoides ferniae*)、*Criconemoides onoense*、*Criconemoides ornatum*)、双垫刃属 (*Ditylenchus* spp.) (例如续断双垫刃线虫 (*Ditylenchus dipsaci*))、锥线虫属 (*Dolichodorus* spp.)、球异皮线虫属 (*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 (*Helicotylenchus* spp.) (例如双宫螺旋线虫 (*Helicotylenchus dihystera*))、半轮线虫属 (*Hemicriconemoides* spp.)、鞘线虫属 (*Hemicycliophora* spp.)、异皮线虫属 (*Heterodera* spp.) (例如燕麦胞囊线虫 (*Heterodera avenae*)、大豆胞囊线虫 (*Heterodera glycines*)、甜菜胞囊线虫 (*Heterodera schachtii*))、潜根线虫属 (*Hirschmaniella* spp.)、纽带线虫属 (*Hoplolaimus* spp.)、长针线虫属 (*Longidorus* spp.) (例如非洲长针线虫 (*Longidorus africanus*))、根结线虫属 (*Meloidogyne* spp.) (例如哥伦比亚根结线虫 (*Meloidogyne chitwoodi*)、伪根结线虫 (*Meloidogyne fallax*)、北方根结线虫 (*Meloidogyne hapla*)、南方根结线虫 (*Meloidogyne incognita*))、瓢线虫属 (*Meloinema* spp.)、珍珠线虫属 (*Nacobbus* spp.)、拟茎线虫属 (*Neotylenchus* spp.)、拟长针线虫属 (*Paralongidorus* spp.)、拟滑刃线虫属 (*Paraphelenchus* spp.)、拟毛刺线虫属 (*Paratrichodorus* spp.) (例如次拟毛刺线虫 (*Paratrichodorus minor*))、针线虫属 (*Paratylenchus* spp.)、短体线虫属 (*Pratylenchus* spp.) (例如穿刺短体线虫 (*Pratylenchus penetrans*))、*Pseudohalenchus* 属种、平滑垫刃属 (*Psilenchus* spp.)、斑皮胞囊线虫属 (*Punctodera* spp.)、五沟线虫属 (*Quinisulcius* spp.)、穿孔线虫属 (*Radopholus* spp.) (例如柑桔穿孔线虫 (*Radopholus citrophilus*)、香蕉穿孔线虫 (*Radopholus similis*))、肾状线虫属 (*Rotylenchulus* spp.)、盘旋线虫属 (*Rotylenchus* spp.)、盾线虫属 (*Scutellonema* spp.)、亚蛇形线虫属 (*Subanguina* spp.)、毛刺线虫属 (*Trichodorus* spp.) (例如短粗根毛刺线虫 (*Trichodorus obtusus*)、原始毛刺线虫 (*Trichodorus primitivus*))、矮化线虫属 (*Tylenchorhynchus* spp.) (例如饰环矮化线虫 (*Tylenchorhynchus annulatus*))、半穿刺线虫属 (*Tylenchulus* spp.) (例如半穿刺线虫 (*Tylenchulus semipenetrans*))、剑线虫属 (*Xiphinema* spp.) (例如匕首线虫 (*Xiphinema index*))。

[0192] 在一定的浓度和施用率下,式(I)的化合物还可任选地用作除草剂、安全剂、生长调节剂或用于改善植物特性的试剂,用作杀微生物剂和杀配子剂,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)或用作抵抗MLO(类支原体生物)和RLO(类立克次氏体生物)的试剂。如果合适,其还可以用作合成其他活性成分的中间体或前体。

[0193] 制剂

[0194] 本发明还涉及作为农药的包含至少一种式(I)的化合物的制剂和由其制备的使用形式,例如浸液、滴注和喷洒液。任选地,使用形式还包含具有改善作用的其他农药和/或佐剂如渗透剂,例如植物油(如油菜籽油、葵花籽油)、矿物油(如石蜡油)、植物脂肪酸的烷基

酯(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(如有机或无机铵盐或磷盐,例如硫酸铵或磷酸氢二铵);和/或保持促进剂,例如磺基丁二酸二辛酯或羟丙基瓜尔胶聚合物;和/或湿润剂,例如甘油;和/或肥料,例如含铵、含钾或含磷的肥料。

[0195] 常规的制剂例如水溶性液体剂(SL)、乳液浓缩剂(EC)、水乳剂(EW)、悬浮浓缩剂(SC、SE、FS、OD)、水分散性颗粒剂(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被国际作物生命组织(Crop Life International)记载并在以下文献中描述:《农药标准》、《联合国粮农组织和世界卫生组织农药标准开发与使用手册》、《联合国粮农组织植物生产与保护文献-173》(由联合国粮农组织(FAO)/世界卫生组织(WHO)关于农药手册的联合会议制订,2004,ISBN:9251048576)。除了一种或多种式(I)的化合物外,所述制剂还任选地包含其他农用化学活性化合物。

[0196] 优选包含下述物质的制剂或使用形式:助剂,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,如佐剂。在本发明的上下文中,佐剂是增强制剂的生物功效的组分,而该组分本身不具有任何生物功效。佐剂的实例为促进保持、铺展、附着到叶面或渗透的试剂。

[0197] 这些制剂以已知方式制备,例如通过将式(I)的化合物与助剂混合而制备,所述助剂例如增量剂、溶剂和/或固体载体和/或其他助剂如表面活性剂。所述制剂在合适的设备中制备,或在施用前或施用过程中制备。

[0198] 所使用的助剂可为适于将特定的特性(例如某些物理、工业和/或生物特性)赋予式(I)的化合物的制剂或由这些制剂制备的使用形式(如即用型(ready-to-use)农药,如喷雾液体或拌种剂产品)的物质。

[0199] 合适的增量剂例如水、极性和非极性有机化学液体,例如选自:芳族烃和非芳族烃(如石蜡、烷基苯、烷基萘、氯苯)、醇和多元醇(如果合适的话,其还可被取代、醚化和/或酯化)、酮(如丙酮、环己酮)、酯(包括脂肪和油)和(聚)醚、简单的胺和取代的胺、酰胺、内酰胺(如N-烷基吡咯烷酮)和内酯、砜和亚砜(如二甲基亚砜)。

[0200] 如果所用的增量剂是水,则还可使用例如有机溶剂作为助溶剂。有用的液体溶剂主要为:芳族化合物,如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯代芳族烃或氯代脂族烃,如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,如环己烷或石蜡,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砜;以及水。

[0201] 原则上,可使用所有合适的溶剂。合适的溶剂的实例为:芳族烃,如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯代芳族烃或氯代脂族烃,如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,如环己烷、石蜡、石油馏分、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,如二甲基亚砜;以及水。

[0202] 原则上,可使用所有合适的载体。有用的载体尤其包括:例如,铵盐和天然的细磨岩石,如高岭土、氧化铝、滑石、白垩、石英、绿坡缕石、蒙脱石或硅藻土;以及合成的细磨岩石,如高度分散的二氧化硅、氧化铝和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;以及无机和有机粉的合成颗粒;以及有机材料的颗

粒,如锯屑、纸、椰壳、玉米穗轴和烟草茎。

[0203] 还可使用液化的气体增量剂或溶剂。特别合适的增量剂或载体是在标准温度和大气压下为气态的那些,例如,气溶胶喷射剂(aerosol propellant),如卤代烃,以及丁烷、丙烷、氮气和二氧化碳。

[0204] 具有离子或非离子性质的乳化剂和/或发泡剂、分散剂或润湿剂、或这些表面活性物质的混合物的实例为:聚丙烯酸的盐;木素磺酸的盐;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的缩聚物、环氧乙烷与取代的酚(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;以及含硫酸根、磺酸根和磷酸根的化合物的衍生物,例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐、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当在水中进行施用,则表面活性剂的存在是有利的。

[0205] 可存在于制剂和由其获得的使用形式中的其他助剂包括:染料,例如无机颜料,如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝;和有机染料,如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料;以及营养物和微量营养物,如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

[0206] 可存在的其他组分为稳定剂,如低温稳定剂、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂或提高化学和/或物理稳定性的其他试剂。还可存在发泡剂和消泡剂。

[0207] 此外,制剂和由其获得的使用形式还可包含下述物质作为其他的助剂:粘着剂,如羧甲基纤维素;以及粉末、颗粒、乳胶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、卵磷脂和合成磷脂。其他助剂可以为矿物油和植物油。

[0208] 如果合适,制剂和由其获得的使用形式中还可存在其他助剂。这样的添加剂的实例为香料、保护胶体、粘合剂(binder)、胶粘剂(adhesive)、增稠剂、触变剂、渗透剂、保持促进剂、稳定剂、螯合剂、络合剂、保湿剂、展着剂。一般而言,式(I)的化合物可与通常用于制剂目的的任何固体或液体添加剂相结合。

[0209] 有用的保持促进剂包括所有降低动态表面张力的物质,如磺基琥珀酸二辛酯;或提高粘弹性的所有那些物质,如羟丙基瓜尔胶聚合物。

[0210] 在本发明的上下文中,有用的渗透剂为通常所有用于增强活性农用化学成分向植物内渗透的物质。在本文中,渗透剂通过以下来定义:它们由(通常水性的)施用液体和/或由喷雾涂层渗透到植物的表皮,从而增加活性成分在表皮中的移动性的能力。可使用文献(Baur等人,1997,Pesticide Science 51,131-152)中记载的方法来测定此特性。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,如菜籽油甲酯或大豆油甲酯;脂肪胺烷氧基化物,如牛油胺乙氧基化物(15);或铵盐和/或磷盐,如硫酸铵或磷酸氢二铵。

[0211] 所述制剂优选包含0.0000001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,基于所述制剂的重量计。

[0212] 在由制剂制备的使用形式(尤其是农药)中,式(I)的化合物的含量可在宽泛的范围内变化。在使用形式中,式(I)的化合物的浓度通常可为0.0000001重量%至95重量%的

式(I)的化合物,优选0.00001重量%至1重量%,基于使用形式的重量计。施用以适合于使用形式的常规方式进行。

[0213] 混合物

[0214] 式(I)的化合物还可以与一种或多种合适的下述物质的混合物的形式使用:杀真菌剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀软体动物剂、杀线虫剂、杀虫剂、微生物剂、有益生物、除草剂、肥料、驱鸟剂、植物增强剂(phytotonic)、止繁殖剂、安全剂、化学信息素和/或植物生长调节剂,从而例如拓宽作用谱、延长作用周期、提高作用速率、防止排斥或防止抗性发展。此外,这类活性成分结合物可以改善植物生长和/或对非生物因素的耐受性,如对高温或低温、干旱或高含水量或土壤盐度的耐受性。还可能改善开花和结果性能、优化发芽能力和根系发育、促进采收和提高产量、影响熟化、改善采收产品的品质和/或营养价值、延长采收产品的储存期和/或改善其可加工性能。

[0215] 此外,式(I)的化合物可以与其他活性化合物或化学信息素如引诱剂和/或驱鸟剂和/或植物活化剂和/或生长调节剂和/或肥料的混合物形式存在。同样地,式(I)的化合物可用于改善植物性能如采收物的生长、产量和品质。

[0216] 在本发明的一个特别的实施方案中,在制剂或由这些制剂制备的使用形式中,式(I)的化合物与其他化合物,优选与下文所述的那些化合物的混合物的形式存在。

[0217] 如果下述化合物之一可以不同的互变异构形式存在,则这些形式同样也包括在内,即使没有分别明确提及。如果可以,所提及的所有混合组分也可以与合适的碱或酸形成盐,条件是基于其官能团能够与合适的碱或酸形成盐。

[0218] 杀虫剂/杀螨剂/杀线虫剂

[0219] 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“农药手册”(The Pesticide Manual”,第16版,British Crop Protection Council 2012)中,或者可以在互联网(例如<http://www.alanwood.net/pesticides>)上检索到。分类是基于在提交本专利申请时适用的IRAC模式的作用分类表(IRAC Mode of Action Classification Scheme)。

[0220] (1)乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂,例如氨基甲酸酯类,例如棉铃威(alanycarb)、涕灭威(aldicarb)、噁虫威(bendiocarb)、丙硫克百威(benfuracarb)、丁酮威(butocarboxim)、丁酮砜威(butoxycarboxim)、甲萘威(carbaryl)、克百威(carbofuran)、丁硫克百威(carbosulfan)、乙硫苯威(ethiofencarb)、仲丁威(fenobucarb)、伐虫脒(formetanate)、呋线威(furathiocarb)、异丙威(isoprocarb)、灭虫威(methiocarb)、灭多威(methomyl)、速灭威(metolcarb)、杀线威(oxamyl)、抗蚜威(pirimicarb)、残杀威(propoxur)、硫双威(thiodicarb)、久效威(thiofanox)、啉蚜威(triazamate)、混杀威(trimethacarb)、灭除威(XMC)和灭杀威(xylylcarb);或有机磷酸酯类,例如乙酰甲胺磷(acephate)、甲基吡啉磷(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)、甲基毒死蜱(chloropyrifos-methyl)、蝇毒磷(coumaphos)、杀螟腈(cyanophos)、甲基内吸磷(demeton-S-methyl)、二嗪农(diazinon)、敌敌畏(dichlorvos/DDVP)、百治磷(dicrotophos)、乐果(dimethoate)、甲基毒虫畏(dimethylvinphos)、乙拌磷(disulfoton)、苯硫磷(EPN)、乙硫磷(ethion)、灭线磷

(ethoprophos)、伐灭磷(famphur)、苯线磷(fenamiphos)、杀螟松(fenitrothion)、倍硫磷(fenthion)、噻唑磷(fosthiazate)、庚烯磷(heptenophos)、imicyafos、异柳磷(isofenphos)、邻-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸异丙酯、异噁唑啉(isoxathion)、马拉硫磷(malathion)、灭蚜磷(mecarbam)、甲胺磷(methamidophos)、杀扑磷(methidathion)、速灭磷(mevinphos)、久效磷(monocrotophos)、二溴磷(naled)、氧乐果(omethoate)、亚砷磷(oxydemeton-methyl)、对硫磷甲酯(parathion-methyl)、稻丰散(phenthoate)、甲拌磷(phorate)、伏杀磷(phosalone)、亚胺硫磷(phosmet)、磷胺(phosphamidon)、膈硫磷(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(triclorfon)和蚜灭磷(vamidothion)。

[0221] (2) GABA-门控GABA门控通道阻滞剂,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)。

[0222] (3) 钠通道调节剂,例如拟除虫菊酯(pyrethroid)类,例如氟丙菊酯(acrinathrin)、烯丙菊酯(allethrin)、d-顺-反烯丙菊酯(d-cis-trans allethrin)、d-反丙烯除虫菊酯(d-trans allethrin)、联苯菊酯(bifenthrin)、生物烯丙菊酯(bioallethrin)、生物烯丙菊酯S-环戊烯基异构体(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(beta-cyfluthrin)、氯氟氰菊酯(cyhalothrin)、 λ -氯氟氰菊酯(lambda-cyhalothrin)、 γ -氯氟氰菊酯(gamma-cyhalothrin)、氯氰菊酯(cypermethrin)、 α -氯氰菊酯(alpha-cypermethrin)、 β -氯氰菊酯(beta-cypermethrin)、 θ -氯氰菊酯(theta-cypermethrin)、 ζ -氯氰菊酯(zeta-cypermethrin)、苯醚氰菊酯[(1R)-反式异构体](cyphenothrin[(1R)-trans isomer])、溴氰菊酯(deltamethrin)、右旋烯炔菊酯[(EZ)-(1R)异构体](empenthrin[(EZ)-(1R) isomer])、高氰戊菊酯(esfenvalerate)、醚菊酯(etofenprox)、甲氰菊酯(fenpropathrin)、氰戊菊酯(fenvalerate)、氟氰戊菊酯(flucythrinate)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、 τ -氟胺氰菊酯(tau-fluvalinate)、苄呋醚(halfenprox)、炔咪菊酯(imiprothrin)、噻噁菊酯(kadethrin)、甲氧苄氟菊酯(momfluorothrin)、苄氯菊酯(permethrin)、苯醚菊酯[(1R)-反式异构体](phenothrin[(1R)-trans isomer])、炔丙菊酯(prallethrin)、除虫菊酯(pyrethrine、pyrethrum)、苄呋菊酯(resmethrin)、氟硅菊酯(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin)、胺菊酯(tetramethrin)、胺菊酯[(1R)异构体](tetramethrin[(1R) isomer]))、四溴菊酯(tralomethrin)和四氟苯菊酯(transfluthrin)或DDT或甲氧氯。

[0223] (4) 烟碱乙酰胆碱受体(nAChR)竞争性调节剂,例如新烟碱类(neonicotinoid),例如啉虫脒(acetamiprid)、噁虫胺(clothianidin)、呋虫胺(dinotefuran)、吡虫啉(imidacloprid)、烯啉虫胺(nitenpyram)、噁虫啉(thiacloprid)和噁虫嗪(thiamethoxam)或尼古丁(nicotine)或氟啉虫胺脒(sulfoxaflo)或氟吡呋喃酮(flupyradifurone)。

- [0224] (5) 烟碱乙酰胆碱受体 (nAChR) 变构调节剂, 例如多杀菌素类 (spinosyn), 如乙基多杀菌素 (spinetoram) 和多杀菌素 (spinosad)。
- [0225] (6) 谷氨酸门控氯化物通道 (GluCl) 变构调节剂, 例如, 阿维菌素类/米尔倍霉素类 (avermectin/milbemycin), 例如阿维菌素 (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)。
- [0226] (7) 保幼激素模仿物, 例如, 保幼激素类似物如烯虫乙酯 (hydroprene)、烯虫炔酯 (kinoprene) 和烯虫酯 (methoprene) 或苯氧威 (fenoxycarb) 或吡丙醚 (pyriproxyfen)。
- [0227] (8) 各种非特异性 (多位点) 抑制剂, 例如烷基卤化物, 例如甲基溴化物和其他烷基卤化物; 或氯化苦 (chloropicrin) 或硫酰氟或硼砂或吐酒石 (tartar emetic) 或异氰酸甲酯发生剂 (generator), 例如棉隆 (diazomet) 和威百亩 (metam)。
- [0228] (9) 脊索器官调节剂, 例如吡蚜酮 (pymetrozine) 或氟啶虫酰胺 (flonicamide)。
- [0229] (10) 螨生长抑制剂, 例如四螨嗪 (clofentezine)、噻螨酮 (hexythiazox) 和氟螨嗪 (diflovidazin) 或乙螨唑 (etoxazole)。
- [0230] (11) 昆虫中肠膜微生物干扰剂, 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 B.t. 植物蛋白: Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、VIP3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/35Ab1。
- [0231] (12) 线粒体 ATP 合成酶抑制剂, 例如 ATP 干扰剂, 例如丁醚脲 (diafenthiuron) 或有机锡化合物, 例如三唑锡 (azocyclotin)、三环锡 (cyhexatin) 和苯丁锡 (fenbutatin oxide) 或克螨特 (propargite) 或四氯杀螨砜 (tetradifon)。
- [0232] (13) 中断质子梯度的氧化磷酸化的解联剂, 例如虫螨脒 (chlorfenapyr)、二硝甲酚 (DNOC) 和氟虫胺 (sulfluramid)。
- [0233] (14) 烟碱乙酰胆碱受体通道阻滞剂, 例如杀虫磺 (bensultap)、杀螟丹盐酸盐 (cartap hydrochloride)、杀虫环 (thiocyclam) 和杀虫双 (thiosultap-sodium)。
- [0234] (15) 0 型几丁质生物合成抑制剂, 例如双三氟虫脲 (bistrifluron)、定虫隆 (chlofluazuron)、除虫脲 (diflubenzuron)、氟环脲 (flucycloxuron)、氟虫脲 (flufenoxuron)、氟铃脲 (hexaflumuron)、虱螨脲 (lufenuron)、双苯氟脲 (novaluron)、多氟脲 (noviflumuron)、氟苯脲 (teflubenzuron) 和杀铃脲 (triflumuron)。
- [0235] (16) 1 型几丁质生物合成的抑制剂, 例如噻嗪酮 (buprofezin)。
- [0236] (17) 蜕皮干扰剂 (特别是在双翅目的情况下), 例如灭蝇胺 (cyromazine)。
- [0237] (18) 蜕皮激素受体激动剂, 例如环虫酰胺 (chromafenozide)、氯虫酰肼 (halofenozide)、甲氧虫酰肼 (methoxyfenozide) 和虫酰肼 (tebufenozide)。
- [0238] (19) 章鱼胺受体激动剂, 例如双甲脒 (amitraz)。
- [0239] (20) 线粒体复合物 III 型电子转移抑制剂, 例如氟蚁腓 (hydramethylnone) 或灭螨醌 (acequinocyl) 或噻螨酯 (fluacrypyrim)。
- [0240] (21) 线粒体复合物 I 型电子转移抑制剂, 例如 METI 杀螨剂, 例如啞螨醚

(fenazaquin)、唑螨酯(fenpyroximate)、嘧啶醚(pyrimidifen)、吡啶灵(pyridaben)、吡螨胺(tebufenpyrad)和唑虫酰胺(tolfenpyrad)或鱼藤酮(rotenone)(鱼藤(Derris))。

[0241] (22) 电压依赖性钠通道阻断剂,例如茚虫威(indoxacarb)或氟氟虫脞(metaflumizone)。

[0242] (23) 乙酰辅酶A羧化酶的抑制剂,例如季酮酸(tetronic)和特特拉姆酸(tetramic acid)衍生物,例如螺螨酯(spirodiclofen)、螺甲螨酯(spiromesifen)和螺虫乙酯(spirotetramat)。

[0243] (24) 线粒体复合物IV型电子转移抑制剂,例如膦类,如磷化铝、磷化钙、膦和磷化锌;或氰化物,氰化钙、氰化钾和氰化钠。

[0244] (25) 线粒体复合物II型电子转移抑制剂,例如 β -酮基脒衍生物,例如吡螨酯(cyenopyrafen)和丁氟螨酯(cyflumetofen),以及羧酰苯胺,例如pyflubumide。

[0245] (28) 兰尼碱(ryanodine)受体调节剂,例如二酰胺类,如氯虫苯甲酰胺(chlorantraniliprole)、溴氰虫酰胺(cyantraniliprole)和氟虫双酰胺(flubendiamide),

[0246] 其他活性成份,例如啉喃环丙虫酯(afidopyropen)、阿福拉纳(afoxolaner)、印楝素(azadirachtin)、benclotiaz、苯螨特(benzoximate)、联苯肼酯(bifenazate)、溴虫氟苯双酰胺(broflanilide)、溴螨酯(bromopropylate)、灭螨猛(chinomethionat)、氯丙炔菊酯(chloroprallethrin)、冰晶石(cryolite)、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)、 ϵ -甲氟菊酯(epsilon metofluthrin)、 ϵ -氟氯菊酯(epsilon momfluthrin)、flometoquin、三氟咪啉酰胺(fluzaindolizine)、氟噻虫砒(flusulfone)、噻虫胺(flufenimer)、氟菌螨酯(flufenoxystrobin)、丁虫脒(flufiprole)、fluhexafon、氟吡菌酰胺(flupyram)、氟雷拉纳(fluralaner)、fluxametamide、呋喃虫酰肼(fufenozide)、戊吡虫脒(guadipyr)、heptafluthrin、氯噻啉(imidaclothiz)、异菌脲(iprodione)、 κ -联苯菊酯(kappa bifenthrin)、 κ -氟氯菊酯(kappa tefluthrin)、lotilaner、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、哌虫啉(paichongding)、三氟甲吡啉(pyridalyl)、pyrifluquinazon、嘧啶胺(pyriminostrobin)、spirobudiofen、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)、氟氰虫酰胺(tetraniliprole)、四氟虫酰胺(tetrachlorantraniliprole)、tioazafen、硫氟脒醚(thiofluoximate)、三氟苯嘧啉(triflumezopyrim)和碘甲烷(iodomethane);以及另外基于坚强芽孢杆菌(Bacillus firmus, I-1582, BioNeem, Votivo)的制剂,以及下列化合物: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)(CAS 885026-50-6)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吡啶-3,4'-哌啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮(由W02003/106457已知)(CAS 637360-23-7)、2-氯-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]哌啶-4-基}-4-(三氟甲基)苯基]异烟酰胺(由W02006/003494已知)(CAS 872999-66-1)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-4-羟基-8-甲氧基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(由W0 2010052161已知)(CAS 1225292-17-0)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙基碳酸酯(由EP 2647626已知)(CAS-1440516-42-6)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基哌啶-1-基)-5-氟嘧啶(由W02004/099160已知)(CAS 792914-58-0)、PF1364

(由JP2010/018586已知) (CAS登记号1204776-60-2)、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) (CAS 1363400-41-2)、(3E)-3-[1-[(6-氯-3-吡啶) 甲基]-2-亚吡啶基]-1,1,1-三氟丙-2-酮(由W02013/144213已知) (CAS 1461743-15-6)、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) (CAS 1226889-14-0)、5-溴-4-氯-N-[4-氯-2-甲基-6-(甲基氨基甲酰基) 苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基) 吡啶-3-羧酰胺(由CN103232431已知) (CAS 1449220-44-3)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-甲基-N-(顺-1-氧代-3-硫杂环丁烷基) 苯甲酰胺、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-甲基-N-(反-1-氧代-3-硫杂环丁烷基) 苯甲酰胺和4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-甲基-N-(顺-1-氧代-3-硫杂环丁烷基) 苯甲酰胺(由W0 2013/050317 A1已知) (CAS 1332628-83-7)、N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡啶-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基) 亚磺酰基] 丙酰胺、(+)-N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡啶-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基) 亚磺酰基] 丙酰胺和(-)-N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡啶-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基) 亚磺酰基] 丙酰胺(由W0 2013/162715 A2、W0 2013/162716 A2、US 2014/0213448 A1已知) (CAS 1477923-37-7)、5-[[(2E)-3-氯-2-丙烯-1-基] 氨基]-1-[2,6-二氯-4-(三氟甲基) 苯基]-4-[(三氟甲基) 亚磺酰基]-1H-吡啶-3-甲腈(由CN 101337937 A已知) (CAS 1105672-77-2)、3-溴-N-[4-氯-2-甲基-6-[(甲基氨基) 硫代甲基] 苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡啶-5-羧酰胺、(Liudaibenjiaxuanan,由CN 103109816 A已知) (CAS 1232543-85-9);N-[4-氯-2-[[(1,1-二甲基乙基) 氨基] 羰基]-6-甲基苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(氟甲氧基)-1H-吡啶-5-羧酰胺(由W0 2012/034403 A1已知) (CAS 1268277-22-0)、N-[2-(5-氨基-1,3,4-噁二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡啶-5-羧酰胺(由W0 2011/085575 A1已知) (CAS 1233882-22-8)、4-[3-[2,6-二氯-4-[(3,3-二氯-2-丙烯-1-基) 氧基] 苯氧基] 丙氧基]-2-甲氧基-6-(三氟甲基) 嘧啶(由CN 101337940 A已知) (CAS 1108184-52-6); (2E)-和2 (Z)-2-[2-(4-氰基苯基)-1-[3-(三氟甲基) 苯基] 亚乙基]-N-[4-(二氟甲氧基) 苯基] 肼甲酰胺(由CN 101715774 A已知) (CAS 1232543-85-9); 环丙烷羧酸3-(2,2-二氯乙烯基)-2,2-二甲基-4-(1H-苯并咪唑-2-基) 苯基酯(由CN 103524422 A已知) (CAS 1542271-46-4); (4aS)-7-氯-2,5-二氢-2-[[(甲氧基羰基) [4-[(三氟甲基) 硫代] 苯基] 氨基] 羰基] 茚并[1,2-e][1,3,4] 噁二嗪-4a (3H)-羧酸甲酯(由CN 102391261 A已知) (CAS 1370358-69-2); 6-脱氧-3-O-乙基-2,4-二-O-甲基-1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-五氟乙氧基) 苯基]-1H-1,2,4-三唑-3-基] 苯基] 氨基甲酸酯]- α -L-甘露吡喃糖(由US 2014/0275503 A1已知) (CAS 1181213-14-8); 8-(2-环丙基甲氧基-4-三氟甲基苯氧基)-3-(6-三氟甲基哒嗪-3-基)-3-氮杂双环[3.2.1] 辛烷(CAS 1253850-56-4)、(8-反式)-8-(2-环丙基甲氧基-4-三氟甲基苯氧基)-3-(6-三氟甲基哒嗪-3-基)-3-氮杂双环[3.2.1] 辛烷(CAS 933798-27-7)、(8-顺式)-8-(2-环丙基甲氧基-4-三氟甲基苯氧基)-3-(6-三氟甲基哒嗪-3-基)-3-氮杂双环[3.2.1] 辛烷(由W0 2007040280 A1、W0 2007040282 A1已知) (CAS 934001-66-8) 和N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡啶-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基) 硫代] 丙酰胺(由W0 2015/058021 A1、W0 2015/058028 A1已知) (CAS 1477919-27-9)。

[0247] 杀真菌剂

[0248] 本文中以其“通用名称”指定的活性化合物是已知的,并且描述于例如“农药手册”(第16版, British Crop Protection Council)中或者在互联网(例如:<http://www.alanwood.net/pesticides>)上是可检索的。

[0249] 如果可以,类别(1)至(15)中提及的所有混合组分可以与合适的碱或酸形成盐,条件是基于其官能团能够与合适的碱或酸形成盐。如果可以,类别(1)至(15)所提及的所有杀真菌混合组分可以包括互变异构形式。

[0250] 1) 麦角甾醇生物合成抑制剂,例如(1.001)环丙唑醇(cyproconazole)、(1.002)苯醚甲环唑(difenoconazole)、(1.003)氟环唑(epoxiconazole)、(1.004)环酰菌胺(fenhexamid)、(1.005)苯锈啉(fenpropidin)、(1.006)丁苯吗啉(fenpropimorph)、(1.007)胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)、(1.008)氟喹唑(fluquinconazole)、(1.009)粉唑醇(flutriafol)、(1.010)抑霉唑(imazalil)、(1.011)抑霉唑硫酸盐(imazalil sulphate)、(1.012)种菌唑(ipconazole)、(1.013)叶菌唑(metconazole)、(1.014)腈菌唑(myclobutanil)、(1.015)多效唑(paclobutrazol)、(1.016)咪鲜胺(prochloraz)、(1.017)丙环唑(propiconazole)、(1.018)丙硫菌唑(prothioconazole)、(1.019)啉菌噁唑(pyrisoxazole)、(1.020)螺环菌胺(spiroxamine)、(1.021)戊唑醇(tebuconazole)、(1.022)四氟醚唑(tetraconazole)、(1.023)三唑醇(triadimenol)、(1.024)十三吗啉(tridemorph)、(1.025)灭菌唑(triticonazole)、(1.026) (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、(1.027) (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、(1.028) (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、(1.029) (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、(1.030) (2R)-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、(1.031) (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、(1.032) (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、(1.033) (2S)-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、(1.034) (R)-[3-(4-氯-2-氟苄基)-5-(2,4-二氟苄基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.035) (S)-[3-(4-氯-2-氟苄基)-5-(2,4-二氟苄基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.036) [3-(4-氯-2-氟苄基)-5-(2,4-二氟苄基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.037) 1-({(2R,4S)-2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-4-甲基-1,3-二氧戊环-2-基}甲基)-1H-1,2,4-三唑、(1.038) 1-({(2S,4S)-2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-4-甲基-1,3-二氧戊环-2-基}甲基)-1H-1,2,4-三唑、(1.039) 1-[[3-(2-氯苄基)-2-(2,4-二氟苄基)环氧乙烷-2-基]甲基]-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.040) 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-氯苄基)-2-(2,4-二氟苄基)环氧乙烷-2-基]甲基]-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.041) 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-氯苄基)-2-(2,4-二氟苄基)环氧乙烷-2-基]甲基]-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-二氯苄基)-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、(1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-二氯苄基)-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、(1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-二氯苄基)-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、(1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-二氯苄基)-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、(1.046) 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、(1.047) 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、(1.048) 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、(1.049) 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、(1.050) 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、(1.051) 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、(1.052) 2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.053) 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、(1.054) 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、(1.055) 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、(1.056) 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、(1.057) 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、(1.058) 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、(1.059) 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、(1.060) 5-(烯丙基硫基(allylsulphonyl))-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、(1.061) 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、(1.062) 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、(1.063) N'-(2,5-二甲基-4-[[3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]硫基(sulphonyl)]苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(1.064) 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、(1.065) 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、(1.066) 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、(1.067) 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、(1.068) 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、(1.069) 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、(1.070) 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、(1.071) N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(1.072) 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、(1.073) 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、(1.074) 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、(1.075) N'-(4-[(4,5-二氯-1,3-噁唑-2-基)氧基]-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亚氨基甲酰胺、(1.076) 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、(1.077) 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、(1.078) N'-(5-溴-6-[(顺-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、(1.079) N'-(5-溴-6-[(反-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、(1.080) 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。

[0251] 2) 呼吸链复合物I或II抑制剂,例如(2.001) 苯并烯氟菌唑(benzovindiflupyr)、(2.002) 联苯吡菌胺(bixafen)、(2.003) 啉酰菌胺(boscalid)、(2.004) 萎锈灵(carboxin)、(2.005) 氟吡菌酰胺(fluopyram)、(2.006) 氟酰胺(flutolanil)、(2.007) 氟唑菌酰胺(fluxapyroxad)、(2.008) 呋吡菌胺(furametpyr)、(2.009) 噻吩酰菌酮(isofetamid)、(2.010) 吡唑萘菌胺(isopyrazam) (反式差向异构对映异构体1R,4S,9S)、(2.011) 吡唑萘菌胺(反式差向异构对映异构体1S,4R,9R)、(2.012) 吡唑萘菌胺(反式差向异构外消旋体1RS,4SR,9SR)、(2.013) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构外消旋体1RS,4SR,9RS和反式差向异构外消旋体1RS,4SR,9SR的混合物)、(2.014) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构对映异构体1R,4S,9R)、(2.015) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构对映异构体1S,4R,9S)、(2.016) 吡唑萘菌胺(顺式差向异构外消旋体1RS,4SR,9RS)、(2.017) 戊苯吡菌胺(penflufen)、(2.018) 吡噻菌胺(penthiopyrad)、(2.019) pydiflumetofen、(2.020) pyraziflumid、(2.021) 氟唑环菌胺(sedaxane)、(2.022) 1,3-二甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡啶-4-羧酰胺、(2.023) 1,3-二甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡啶-4-羧酰胺、(2.024) 1,3-二甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡啶-4-羧酰胺、(2.025) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[2'-(三氟甲基)联苯基-2-基]-1H-吡啶-4-羧酰胺、(2.026) 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、(2.027) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡啶-4-羧酰胺、(2.028) 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-吡啶-4-羧酰胺、(2.029) 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-吡啶-4-羧酰胺、(2.030) 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-吡啶-4-羧酰胺、(2.031) 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-吡啶-4-羧酰胺、(2.032) 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-吡啶-4-羧酰胺、(2.033) 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、(2.034) 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、(2.035) 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、(2.036) 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、(2.037) 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、(2.038) 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、(2.039) N-[(1R,4S)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-亚甲基萘(methanonaphthalen)-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-羧酰胺、(2.040) N-[(1S,4R)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-亚甲基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-羧酰胺、(2.041) N-[1-(2,4-二氯苯基)-1-甲氧基丙-2-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-羧酰胺、(2.042) 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、(2.043) 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、(2.044) 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、(2.045) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-

氟-1-甲基-N-[5-甲基-2-(三氟甲基)苄基]-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.046) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-氟-6-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.047) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基-5-甲基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.048) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-硫代羧酰胺、(2.049) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.050) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(5-氟-2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.051) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-4,5-二甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.052) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-氟苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.053) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.054) N-环丙基-N-(2-环丙基-5-氟苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.055) N-环丙基-N-(2-环丙基-5-甲基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺、(2.056) N-环丙基-N-(2-环丙基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酰胺。

[0252] 3) 呼吸链复合物III抑制剂,例如(3.001) 唑啉菌胺(ametocetradin)、(3.002) 吡唑磺菌胺(amisulbrom)、(3.003) 噻菌酯(azoxystrobin)、(3.004) 甲香菌酯(coumethoxystrobin)、(3.005) 丁香菌酯(coumoxystrobin)、(3.006) 氰霜唑(cyazofamid)、(3.007) 醚菌胺(dimoxystrobin)、(3.008) 烯肟菌酯(enoxastrobin)、(3.009) 噁唑菌酮(famoxadon)、(3.010) 咪唑菌酮(fenamidon)、(3.011) 氟菌麟酯(flufenoxystrobin)、(3.012) 氟噻菌酯(fluxastrobin)、(3.013) 醚菌酯(kresoxim-methyl)、(3.014) 苯氧菌胺(metominostrobin)、(3.015) 肟醚菌胺(orysastrobin)、(3.016) 啉氧菌酯(picoxystrobin)、(3.017) 唑菌胺酯(pyraclostrobin)、(3.018) 唑胺菌酯(pyrametostrobin)、(3.019) 唑菌酯(pyraoxystrobin)、(3.020) 肟菌酯(trifloxystrobin)、(3.021) (2E)-2-[2-[(1E)-1-(3-[(E)-1-氟-2-苯基乙烯基]氧基)苄基]亚乙基]氨基]氧基]甲基]苄基)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、(3.022) (2E,3Z)-5-[[1-(4-氯苄基)-1H-吡唑-3-基]氧基]-2-(甲氧基亚氨基)-N,3-二甲基戊-3-烯酰胺、(3.023) (2R)-2-[2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苄基]-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺、(3.024) (2S)-2-[2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苄基]-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺、(3.025) (3S,6S,7R,8R)-8-苄基-3-[(3-[(异丁酰基氧基)甲氧基]-4-甲氧基吡啶-2-基]羰基)氨基]-6-甲基-4,9-二氧代-1,5-二氧杂环壬烷(dioxonan)-7-基-2-甲基丙酸酯、(3.026) 2-[2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苄基]-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺、(3.027) 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、(3.028) (2E,3Z)-5-[[1-(4-氯-2-氟苄基)-1H-吡唑-3-基]氧基]-2-(甲氧基亚氨基)-N,3-二甲基戊-3-烯酰胺。

[0253] 4) 有丝分裂和细胞分裂抑制剂,例如(4.001) 多菌灵(carbendazim)、(4.002) 乙霉威(diethofencarb)、(4.003) 噁唑菌胺(ethaboxam)、(4.004) 氟啉菌胺(fluopicolid)、(4.005) 戊菌隆(pencycuron)、(4.006) 噻菌灵(thiabendazole)、(4.007) 甲基硫菌灵(thiophanate-methyl)、(4.008) 苯酰菌胺(zoxamide)、(4.009) 3-氯-4-(2,6-二氟苄基)-6-甲基-5-苯基哒嗪、(4.010) 3-氯-5-(4-氯苄基)-4-(2,6-二氟苄基)-6-甲基哒嗪、(4.011) 3-氯-5-(6-氯吡啶-3-基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苄基)哒嗪、(4.012) 4-(2-溴-4-氟苄基)-N-(2,6-二氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.013) 4-(2-溴-4-氟苄基)-N-

(2-溴-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.014) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.015) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.016) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.017) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.018) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.019) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.020) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.021) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.022) 4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基哒嗪、(4.023) N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.024) N-(2-溴苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.025) N-(4-氯-2,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺。

[0254] 5) 具有多位点活化作用的化合物,例如(5.001)波尔多液混合物(Bordeaux mixture)、(5.002)敌菌丹(captafol)、(5.003)克菌丹(captan)、(5.004)百菌清(chlorothalonil)、(5.005)氢氧化铜、(5.006)环烷酸铜(copper naphthenate)、(5.007)氧化铜、(5.008)氧氯化铜(copper oxychloride)、(5.009)硫酸铜(2+)、(5.010)二噻农(dithianon)、(5.011)多果定(dodin)、(5.012)灭菌丹(folpet)、(5.013)代森锰锌(mancozeb)、(5.014)代森锰(maneb)、(5.015)代森联(metiram)、(5.016)代森联锌(zinc metiram)、(5.017)8-羟基喹啉铜(copper oxine)、(5.018)丙森锌(propineb)、(5.019)硫和硫制剂包括多硫化钙、(5.020)福美双(thiram)、(5.021)代森锌(zineb)、(5.022)福美锌(ziram)。

[0255] 6) 能够触发宿主防御的化合物,例如(6.001)苯并噻二唑(acibenzolar-S-methyl)、(6.002)异噻菌胺(isotianil)、(6.003)烯丙苯噻唑(probenazole)、(6.004)噻酰菌胺(tiadinil)。

[0256] 7) 氨基酸和/或蛋白质生物合成抑制剂,例如(7.001)啞菌环胺(cyprodinil)、(7.002)春雷霉素(kasugamycin)、(7.003)春雷霉素盐酸盐水合物(kasugamycin hydrochloride hydrate)、(7.004)氧四环素(oxytetracycline)、(7.005)啞霉胺(pyrimethanil)、(7.006)3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉。

[0257] (8) ATP生成抑制剂,例如(8.001)硅噻菌胺(silthiofam)。

[0258] 9) 细胞壁合成抑制剂,例如(9.001)苯噻菌胺(benthiavalicarb)、(9.002)烯酰吗啉(dimethomorph)、(9.003)氟吗啉(flumorph)、(9.004)异丙菌胺(iprovalicarb)、(9.005)双炔酰菌胺(mandipropamid)、(9.006)丁吡吗啉(pyrimorph)、(9.007)缬菌胺(valifenalate)、(9.008) (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、(9.009) (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。

[0259] 10) 脂类和膜合成抑制剂,例如(10.001)霜霉威(propamocarb)、(10.002)霜霉威盐酸盐(propamocarb hydrochloride)、(10.003)甲基立枯磷(tolclofos-methyl)。

[0260] 11) 黑色素生物合成抑制剂,例如(11.001)三环唑(tricyclazole)、(11.002)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。

[0261] 12) 核酸合成抑制剂,例如(12.001)苯霜灵(benalaxyl)、(12.002)精苯霜灵

(benalaxyl-M) (kiralaxyl)、(12.003) 甲霜灵 (metalaxyl)、(12.004) 精甲霜灵 (metalaxyl-M) (mefenoxam)。

[0262] 13) 信号转导抑制剂,例如(13.001) 咯菌腈 (fludioxonil)、(13.002) 异菌脲 (iprodione)、(13.003) 腐霉利 (procymidone)、(13.004) 丙氧喹啉 (proquinazid)、(13.005) 喹氧灵 (quinoxifen)、(13.006) 乙烯菌核利 (vinclozolin)。

[0263] 14) 能够起解偶联剂作用的化合物,例如(14.001) 氟啶胺 (fluazinam)、(14.002) 消螨多 (meptyldinocap)。

[0264] 15) 其他化合物,例如(15.001) 脱落酸 (abscisic acid)、(15.002) 苯噻硫氰 (benthiazole)、(15.003) bethoxazin、(15.004) 卡巴西霉素 (capsimycin)、(15.005) 香芹酮 (carvone)、(15.006) 灭螨猛 (chinomethionat)、(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) 氟噻菌灵 (flutianil)、(15.012) 三乙膦酸铝 (fosetyl-aluminium)、(15.013) 三乙膦酸钙 (fosetyl-calcium)、(15.014) 三乙膦酸钠 (fosetyl-sodium)、(15.015) 异硫氰酸甲酯、(15.016) 苯菌酮 (metrafenon)、(15.017) 米多霉素 (mildiomycin)、(15.018) 纳他霉素 (natamycin)、(15.019) 二甲基二硫代氨基羧酸镍 (nickel dimethyldithiocarbamate)、(15.020) 酞菌酯 (nitrothal-isopropyl)、(15.021) 奥克斯莫卡宾 (oxamocarb)、(15.022) 氟噻唑吡乙酮 (oxathiapiprolin)、(15.023) 奥施康定 (oxyfenthiin)、(15.024) 五氯苯酚 (pentachlorophenol) 及盐、(15.025) 膦酸及其盐、(15.026) 霜霉威-乙膦酸盐 (propamocarb-fosetilate)、(15.027) 吡奥酚酮 (pyriofenone) (chlazafenone) (15.028) 特弗喹啉 (tebufloquin)、(15.029) 叶枯酞 (tecloftalam)、(15.030) 甲磺菌胺 (tolnifanide)、(15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(15.033) 2-(6-苄基吡啶-2-基)喹唑啉、(15.034) 2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二噻英并 (dithiino) [2,3-c:5,6-c']二吡咯-1,3,5,7 (2H,6H)-四酮、(15.035) 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、(15.036) 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、(15.037) 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、(15.038) 2-[6-(3-氟-4-甲氧基苯基)-5-甲基吡啶-2-基]喹唑啉、(15.039) 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-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基]-3-氯苯基甲磺酸酯、(15.040) 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-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基]-3-氯苯基甲磺酸酯、(15.041) 2-[2-[(7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基)氧基]-6-氟苯基]丙-2-醇、(15.042) 2-[2-氟-6-[(8-氟-2-甲基喹啉-3-基)氧基]苯基]丙-2-醇、(15.043) 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-氯苯基甲磺酸酯、(15.044) 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} 苯基甲磺酸酯、(15.045) 2-苯基苯酚及其盐、(15.046) 3-(4,4,5-三氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基) 喹啉、(15.047) 3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基) 喹啉、(15.048) 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)、(15.049) 4-氧代-4-[(2-苯基乙基)氨基]丁酸、(15.050) 5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇、(15.051) 5-氯-N'-苯基-N'-(丙-2-炔-1-基) 噻吩2-磺酰肼、(15.052) 5-氟-2-[(4-氟苄基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.053) 5-氟-2-[(4-甲基苄基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.054) 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、(15.055) 丁-3-炔-1-基{6-[(Z)-(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基}氧基}甲基]吡啶-2-基}氨基甲酸酯、(15.056) (2Z)-3-氨基-2-氰基-3-苯基丙烯酸乙酯、(15.057) 吩嗪-1-羧酸、(15.058) 3,4,5-三羟基苯甲酸丙酯、(15.059) 喹啉-8-醇、(15.060) 喹啉-8-醇硫酸酯(2:1)、(15.061) {6-[(Z)-(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。

[0265] 作为混合组分的生物农药

[0266] 式(I)的化合物可与生物农药结合。

[0267] 生物农药尤其包括细菌、真菌、酵母、植物提取物和由微生物形成的产物,包括蛋白质和次级代谢物。

[0268] 生物农药包括细菌如形成孢子的细菌(spore-forming bacteria)、根定殖细菌(root-colonizing bacteria)和用作生物杀虫剂、杀真菌剂或杀线虫剂的细菌。

[0269] 用作或可用作生物农药的这类细菌的实例为:

[0270] 解淀粉芽孢杆菌(*Bacillus amyloliquefaciens*),菌株FZB42(DSM231179);或蜡样芽孢杆菌(*Bacillus cereus*),尤其是蜡样芽孢杆菌菌株CNCM I-1562;或者坚强芽孢杆菌(*Bacillus firmus*),菌株I-1582(登录号CNCMI-1582);或短小芽孢杆菌(*Bacillus pumilus*),尤其是菌株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*),尤其是菌株GB03(登录号ATCC SD-1397),或枯草芽孢杆菌菌株QST713(登录号NRRL B-21661)或枯草芽孢杆菌菌株OST 30002(登录号NRRL B-50421);苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*),尤其是苏云金芽孢杆菌以色列亚种(*B.thuringiensis* subspecies *israelensis*)(血清型H-14)、菌株AM65-52(登录号ATCC 1276),或苏云金芽孢杆菌鲇泽亚种(*B.thuringiensis* subsp.*aizawai*),尤其是菌株ABTS-1857(SD-1372),或苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(*B.thuringiensis* subsp.*kurstaki*)菌株HD-1,或苏云金芽孢杆菌tenebrionis亚种(*B.thuringiensis* subsp.*tenebrionis*)菌株NB 176(SD-5428);穿刺巴斯德氏芽菌(*Pasteuria penetrans*)、巴斯德芽菌属(*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)。

[0271] 用作或可用作生物农药的真菌和酵母菌的实例为:

[0272] 球孢白僵菌(*Beauveria bassiana*),尤其是菌株ATCC 74040,盾壳霉(*Coniothyrium minitans*),尤其是菌株CON/M/91-8(登录号DSM-9660);轮枝孢属(*Lecanicillium* spp.),尤其是菌株HRO LEC 12,蜡蚧轮枝菌(*Lecanicillium lecanii*), (曾用名*Verticillium lecanii*),尤其是菌株KV01;金龟子绿僵菌(*Metarhizium*

anisopliae),尤其是菌株F52(DSM3884/ATCC 90448);核果梅奇酵母菌(*Metschnikowia fructicola*),尤其是菌株NRRL Y-30752;玫烟色拟青霉(*Paecilomyces fumosoroseus*) (现用名:玫烟色棒束孢(*Isaria fumosorosea*)),尤其是菌株IFPC 200613,或菌株Apopka 97(登录号ATCC 20874);淡紫拟青霉(*Paecilomyces lilacinus*),尤其是淡紫拟青霉菌株251(AGAL 89/030550);黄色蠕形霉(*Talaromyces flavus*),尤其是菌株V117b;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),尤其是菌株SC1(登录号CBS 122089);哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*),尤其是哈茨木霉T39(登录号CNCM I-952)。

[0273] 用作或可用作生物农药的病毒的实例为:

[0274] 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))颗粒型病毒(GV),棉铃虫(*Helicoverpa armigera*(cotton bollworm))核多角体病毒(NPV),甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua*(beet armyworm))mNPV,草地贪夜蛾(*Spodoptera frugiperda*(秋夜蛾(fall armyworm)))mNPV,海灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis*(美国棉树叶虫(African cotton leafworm))NPV)。

[0275] 还包括作为“接种剂”添加到植物或植物部位或植物器官中的细菌和真菌,这些细菌和真菌通过其特定性质促进植物生长和植物健康。实例包括:

[0276] 土壤杆菌属(*Agrobacterium* spp.)、茎瘤固氮根瘤菌(*Azorhizobium caulinodans*)、固氮螺菌属(*Azospirillum* spp.)、固氮菌属(*Azotobacter* spp.)、慢生根瘤菌属(*Bradyrhizobium* spp.)、伯克霍尔德氏菌属(*Burkholderia* spp.)、尤其是洋葱伯克霍尔德氏菌(*Burkholderia cepacia*) (曾用名洋葱假单胞菌(*Pseudomonas cepacia*))、巨孢囊霉属(*Gigaspora* spp.)、或单孢巨孢囊霉(*Gigaspora monosporum*)、球囊霉属(*Glomus* spp.)、蜡蘑属(*Laccaria* spp.)、布氏乳杆菌(*Lactobacillus buchneri*)、类球囊霉属(*Paraglomus* spp.)、豆包菌(*Pisolithus tinctorius*)、假单胞菌属(*Pseudomonas* spp.)、根瘤菌属(*Rhizobium* spp.)、尤其是三叶草根瘤菌(*Rhizobium trifolii*)、须腹菌属(*Rhizopogon* spp.)、硬皮锈菌属(*Scleroderma* spp.)、乳牛肝菌属(*Suillus* spp.)、链霉菌属(*Streptomyces* spp.)。

[0277] 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(包括蛋白和次级代谢产物)的实例为:

[0278] 大蒜(*Allium sativum*)、苦艾(*Artemisia absinthium*)、印楝素(azadirachtin)、Biokeeper WP、*Cassia nigricans*、苦皮藤(*Celastrus angulatus*)、美洲土荆芥(*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(藜麦皂素(*Chenopodium quinoa saponin*)提取物)、除虫菊/除虫菊酯类、苏里南苦木(*Quassia amara*)、栎树(*Quercus*)、皂树(*Quillaja*)、Regalia、“Requiem™杀虫剂”、鱼藤酮(rotenone)、鱼尼丁/兰尼碱、聚合草(*Symphytum officinale*)、艾菊(*Tanacetum vulgare*)、麝香草酚(thymol)、Triact 70、TriCon、旱金莲(*Tropaeolum majus*)、大荨麻(*Urtica dioica*)、Veratrin、槲寄生(*Viscum album*)、十字花科(Brassicaceae)提取物,特别是油籽油菜粉末或芥末粉末。

[0279] 作为混合组分的安全剂

[0280] 式(I)的化合物可与安全剂结合,所述安全剂例如解草酮(benoxacor)、解草酯(cloquintocet(-mexyl))、解草胺腈(cyometrinil)、环丙磺酰胺(cyprosulfamide)、二氯丙烯胺(dichlormid)、解草唑(fenchlorazole(-ethyl))、解草啉(fenclorim)、解草安(flurazole)、氟草肟(fluxofenim)、解草噁唑(furilazole)、双苯噁唑酸(isoxadifen(-ethyl))、吡唑解草酯(mefenpyr(-diethyl))、萘二甲酸酐(naphthalic anhydride)、解草腈(oxabetrinil)、2-甲氧基-N-{4-[(甲基氨基甲酰基)氨基]苯基}磺酰基苯甲酰胺(CAS 129531-12-0)、4-(二氯乙酰基)-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷(CAS 71526-07-3)、2,2,5-三甲基-3-(二氯乙酰基)-1,3-噁唑烷(CAS 52836-31-4)。

[0281] 植物和植物部位

[0282] 所有的植物和植物部位均可根据本发明进行处理。在本文中,植物应理解为意指所有植物和植物种群,例如期望和不期望的野生植物或作物植物(包括天然存在的作物植物),例如谷物(小麦、稻、黑小麦、大麦、黑麦、燕麦)、玉米、大豆、马铃薯、糖用甜菜、甘蔗、西红柿、甜柿子椒、黄瓜、甜瓜、胡萝卜、西瓜、洋葱、莴苣、菠菜、韭、豆类、甘蓝(Brassica oleracea)(如卷心菜)和其他蔬菜品种,棉花、烟草、油籽油菜,以及水果植物(水果为苹果、梨、柑橘类水果和葡萄)。作物植物可以为通过常规育种和优化方法或通过生物技术方法和基因工程方法或这些方法的组合而获得的植物,包括转基因植物以及包括可受或不受植物育种者权利保护的植物栽培种。植物应当理解为意指所有发育阶段,例如种子、幼苗和早期(未成熟)植物直至且包括成熟植物。植物部位应理解为意指植物的所有地上和地下部位和器官,如芽、叶、花和根,实例为叶、针叶、茎、干、花、子实体、果实和种子、以及根、块茎和根茎。植物部位还包括采收的植物或采收的植物部分以及无性和有性繁殖的材料,例如插条、块茎、根茎、分蘖(slip)和种子。

[0283] 本发明的使用式(I)的化合物对植物和植物部位的处理可通过常规处理方法直接进行或通过使所述化合物作用于其环境、生境或储存空间来进行,例如通过浸渍、喷雾、蒸发、雾化、撒布、涂抹、注射,以及在繁殖材料、尤其是在种子的情况下,还通过施用一层或多层包衣来进行。

[0284] 如上所述,可根据本发明处理所有的植物及其部位。在一个优选的实施方案中,处理野生植物物种和植物栽培种,或处理通过常规生物育种方法如杂交或原生质体融合而获得的那些植物及其部位。在另一优选的实施方案中,处理通过基因工程方法——如果合适与常规方法结合——获得的转基因植物和植物栽培种(基因修饰生物)及其部位。术语“部位”或“植物的部位”或“植物部位”已在上文中解释。根据本发明,特别优选处理相应市售的常规植物栽培种或正在使用中的那些植物。植物栽培种应理解为意指通过常规育种、诱变或重组DNA技术获得的具有新特性(“性状”)的植物。其可以是栽培种、变种、生物型或基因型。

[0285] 转基因植物、种子处理和整合株系(integration event)

[0286] 根据本发明处理的优选的转基因植物或植物栽培种(通过基因工程获得的那些植物)包括通过基因修饰而接受了能赋予这些植物特别有利的有用特性(“性状”)的基因材料的所有植物。这些特性的实例为:更好的植物生长、提高的对高温或低温的耐受性、提高的对干旱或对水或土壤盐度水平的耐受性、提高的开花性能、更容易采收、加速成熟、更高的采收率、采收产品品质更高和/或营养价值更高、采收产品的储存寿命更长和/或可加工性

更好。这些特性的其他和特别强调的实例为：由于例如在植物内形成的毒素、特别是通过来自苏云金芽孢杆菌的基因材料（例如通过基因CryIA (a)、CryIA (b)、CryIA (c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb和CryIF及其组合）在植物中产生的那些毒素而增强了植物对动物害虫和微生物害虫的抗性，例如抵抗昆虫、蛛形纲动物、线虫、螨虫、蛞蝓以及蜗牛；以及通过系统获得性抗性 (SAR)、系统素、植物抗毒素、诱导子和抗性基因及相应表达的蛋白和毒素而增强对植物病原性真菌、细菌和/或病毒的抗性；以及提高植物对特定除草活性化合物例如咪唑啉酮类、磺酰胺类、草甘膦或草胺膦的耐受性（例如“PAT”基因）。赋予所述所需特性（“性状”）的基因还可互相结合地存在于转基因植物中。所述转基因植物的实例包括重要的作物植物，例如谷物（小麦、稻、黑小麦、大麦、黑麦、燕麦）、玉米、大豆、马铃薯、糖用甜菜、甘蔗、西红柿、豌豆和其他蔬菜品种，棉花、烟草、油籽油菜，以及水果植物（水果为苹果、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、烟草和油籽油菜。特别强调的特性（“性状”）是增强植物对昆虫、蛛形纲动物、线虫和蛞蝓以及蜗牛的抗性。

[0287] 作物保护——处理的类型

[0288] 用式 (I) 的化合物使用常规处理方法对植物和植物部位进行直接处理，或通过作用于其环境、生境或储存空间来进行处理，所述常规处理方法为，例如浸渍、喷洒、喷雾、灌溉、蒸发、撒粉、雾化、撒播、发泡、涂抹、撒布、注射、浇水（浇灌）、滴灌，以及在繁殖材料、尤其是种子的情况下，还通用过一层或多层包衣包覆等方法进行干种子处理、液态种子处理、浆料处理。还可以通过超低容量方法施用式 (I) 的化合物，或将施用形式或式 (I) 的化合物本身注射到土壤中。

[0289] 优选的对植物的直接处理为叶面施用，这意指将式 (I) 的化合物施用到叶子上，在此情况下处理频率和施用率应根据所述害虫的侵染水平来调整。

[0290] 在内吸性活性化合物的情况下，式 (I) 的化合物还可以经由根体系进入植物。然后，通过将式 (I) 的化合物作用于植物的生境来处理该植物。这可以通过例如下述方式完成：浇灌；或者通过混入土壤或营养液中，这意指用液体形式的式 (I) 的化合物浸渍植物的生长点（例如土壤或水培体系）；或土壤施用，这意指将根据本发明的式 (I) 的化合物以固体形式（例如以颗粒剂的形式）引入到植物的生长点。在水稻作物的情况下，其还可通过将式 (I) 的化合物以固体施用形式（例如以颗粒剂的形式）计量加入淹没的水稻田中来完成。

[0291] 种子处理

[0292] 通过处理植物的种子来防治动物害虫是早就已知的，并且是不断改进的主题。然而，种子处理产生了一系列始终不能以令人满意的方式来解决的问题。因此，需要开发用于保护种子和发芽植物的方法，所述方法免除或至少显著减少在储存过程中、播种后或植物出苗后额外施用农药。此外还需要优化活性成分的用量，以便为种子和发芽植物提供最佳的保护，使其免受动物害虫的侵染，而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抵抗或耐受害虫的转基因植物所固有的杀虫和/或杀线虫特性，以便用最少量的农药实现对种子和发芽植物的最佳保护。

[0293] 因此，特别地，本发明还涉及一种通过用式 (I) 的化合物之一处理种子来保护种子和发芽植物免受害虫侵染的方法。本发明的保护种子和发芽植物免受害虫侵染的方法还包括这样的方法，其中，在一次操作中同时或依序用式 (I) 的化合物和混合组分处理种子。其

还包括在不同的时间用式 (I) 的化合物和混合组分处理种子的方法。

[0294] 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染的用途。

[0295] 本发明还涉及用本发明的式 (I) 的化合物处理的种子以保护其免受动物害虫侵染。本发明还涉及同时用式 (I) 的化合物和混合组分处理的种子。本发明还涉及在不同时间用式 (I) 的化合物和混合组分处理的种子。在不同时间用式 (I) 的化合物和混合组分处理的种子的情况下,各物质可存在于种子的不同层上。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:其中将式 (I) 的化合物和混合组分作为包衣的一部分或作为除了包衣之外的其他一层或其他几层进行施用。

[0296] 本发明还涉及这样的种子:在用式 (I) 的化合物处理之后,对其进行涂膜处理以避免种子遭受灰尘磨损。

[0297] 当式 (I) 的化合物内吸性地作用时产生的优点之一在于,处理种子不仅保护种子本身,还保护由其生长的植物在出苗后免受动物害虫的侵染。以这种方式,无需在播种时或在其后不久对作物立刻进行处理。

[0298] 另一个优点在于,用式 (I) 的化合物处理种子可促进经处理的种子发芽和出苗。

[0299] 认为同样有利的是,式 (I) 的化合物还可尤其用于转基因种子。

[0300] 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/或内生细菌或真菌)更好的定殖(colonization)和/或优化固氮作用。

[0301] 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,其为以下植物的种子:谷物(例如小麦、大麦、黑麦、粟和燕麦)、玉米、棉花、大豆、稻、马铃薯、向日葵、咖啡、烟草、加拿大油菜、油籽油菜、甜菜(例如糖用甜菜和饲用甜菜)、花生、蔬菜(例如番茄、黄瓜、菜豆、十字花科蔬菜、洋葱和莴苣)、果实植物、草坪植物和观赏性植物的种子。特别重要的是处理谷物(小麦、大麦、黑麦和燕麦)、玉米、大豆、棉花、加拿大油菜、油籽油菜、蔬菜和稻的种子。

[0302] 如上所述,用式 (I) 的化合物处理转基因种子也是特别重要的。这涉及通常包含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虫和/或杀线虫特性的多肽的表达。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*)。本发明特别适用于处理包含至少一种源自芽孢杆菌属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(*Bacillus thuringiensis*)。

[0303] 在本发明的上下文中,将式 (I) 的化合物施用于种子。优选在种子足够稳定以在处理过程中不发生损害的状态下处理种子。通常,可在采收和播种之间的任意时间处理种子。通常使用已从植物中分离并且已除去穗轴、外壳、茎、表皮、毛或果肉的种子。例如,可使用已采收、清洁并干燥至允许贮存的水分含量的种子。或者,还可使用在干燥后例如用水处理(例如灌注)然后再干燥的种子。在稻的种子的情况下,也可以使用例如在水中浸泡直到达到稻胚芽的某一阶段(“胚乳期”)的种子,这导致改善了发芽情况并使出苗更均匀。

[0304] 在处理种子时,通常必须注意选择施用于种子的式 (I) 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损害。对于在某些施用率下可表

现出植物毒性作用的活性成分,必须特别确保这一点。

[0305] 通常,将式(I)的化合物以合适的制剂形式施用于种子。用于种子处理的合适的制剂和方法为本领域技术人员已知。

[0306] 式(I)的化合物可转化为常规的拌种制剂,例如溶液剂、乳剂、悬浮剂、粉剂、泡沫剂、浆剂(slurry)或其他种子包衣组合物,以及ULV制剂。

[0307] 这些制剂用已知方法通过将式(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、粘合剂、赤霉素以及水)。

[0308] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的染料为通常用于此目的的所有染料。可使用微溶于水的颜料或溶于水的染料。实例包括已知的名称为罗丹明B(Rhodamine B)、C.I. 颜料红112和C.I. 溶剂红1的染料。

[0309] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的有用的润湿剂为促进润湿并常用于配制活性农用化学成分的所有物质。优选使用萘磺酸烷基酯,如萘磺酸二异丙酯或萘磺酸二异丁酯。

[0310] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的合适的分散剂和/或乳化剂为常用于配制活性农用化学成分的所有非离子、阴离子和阳离子分散剂。可优选使用非离子或阴离子分散剂,或非离子或阴离子分散剂的混合物。合适的非离子分散剂特别包括环氧乙烷/环氧丙烷嵌段聚合物、烷基酚聚乙二醇醚和三苯乙烯基苯酚聚乙二醇醚,及其磷酸化或硫酸化的衍生物。合适的阴离子分散剂特别为木素磺酸盐、聚丙烯酸盐和芳基磺酸酯-甲醛缩合物。

[0311] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的消泡剂为常用于配制农用化学活性成分的所有抑制泡沫的物质。优选可使用硅酮消泡剂和硬脂酸镁。

[0312] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的防腐剂为可用于此目的的农用化学组合物中的所有物质。实例包括二氯酚和苯醇半缩甲醛。

[0313] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的二次增稠剂为可用于此目的的农用化学组合物中的所有物质。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二氧化硅。

[0314] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的有用粘着剂为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基吡咯烷酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇和甲基纤维素。

[0315] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的赤霉素优选为赤霉素A1、A3(=赤霉酸)、A4和A7;特别优选使用赤霉酸。所述赤霉素是已知的(参见R.Wegler"Chemie der Pflanzenschutz-und **Schädlingsbekämpfungsmittel**",第二卷,Springer Verlag, 1970,第401-412页)。

[0316] 根据本发明可使用的拌种制剂可以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以下种子:谷类(例如小麦、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。可根据本发明使用的拌种制剂或其稀释的使用形式也可用于拌种转基因植物的种子。

[0317] 对于用可根据本发明使用的拌种制剂或由其通过加入水制得的使用形式处理种子而言,常用于拌种的所有混合单元都是有用的。具体而言,拌种的过程为:将种子置于间歇操作或连续操作的混合器中;以其本身或预先用水稀释后,加入特定所需量的拌种制剂;并进行混合直到制剂均匀地分布在种子上。如果合适,随后进行干燥操作。

[0318] 可根据本发明使用的拌种制剂的施用率可在相对宽的范围内变化。这取决于制剂中式(I)的化合物的具体含量以及取决于种子。式(I)的化合物的施用率通常为0.001至50g/千克种子,优选0.01至15g/千克种子。

[0319] 动物健康

[0320] 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、特别是外寄生虫或内寄生虫是有活性的。术语“内寄生虫”特别包括蠕虫和原生动动物,如球虫。外寄生虫通常且优选为节肢动物,尤其是昆虫或螨。

[0321] 在兽医学领域中,具有有利的温血动物毒性的式(I)的化合物适合于防治在家畜、繁育动物、动物园动物、实验室动物、实验动物和家养动物中在动物繁育和动物饲养中出现的寄生虫。其对寄生虫的所有或特定发育阶段有活性。

[0322] 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,以及尤其是牛和猪;或家禽如火鸡、鸭、鹅,以及尤其是鸡;或鱼或甲壳动物,如水产养殖中的鱼或甲壳动物;或者视情况而定,昆虫如蜜蜂。

[0323] 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、两栖动物或观赏鱼。

[0324] 在一个特定的实施方案中,将式(I)的化合物施用于哺乳动物。

[0325] 在另一个特定的实施方案中,将式(I)的化合物施用于禽类,即笼鸟或特别是家禽。

[0326] 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、毛、皮、蛋、蜜等的情况下),从而使得动物饲养更经济且更简单,并可实现更好的动物健康。

[0327] 关于动物健康领域,在本发明的上下文中,术语“防治”意指式(I)的化合物有效地将特定寄生虫在感染此寄生虫的动物中的发生率降低至无害程度。更具体而言,本文中的“防治”意指式(I)的化合物杀死相应的寄生虫、抑制其生长或抑制其繁殖。

[0328] 节肢动物例如包括,但不限于:

[0329] 虱目(Anoplurida),例如血虱属(Haematopinus spp.)、毛虱属(Linognathus spp.)、虱属(Pediculus spp.)、阴虱Phtirus属和管虱属(Solenopotes spp.);

[0330] 食毛目(Mallophagida)和钝角亚目(Amblycerina)和丝角亚目(Ischnocerina),例如牛羽虱属(Bovicola spp.)、畜虱属(Damalina spp.)、猫虱属(Felicola spp.); Lepikentron属、禽虱属(Menopon spp.)、嚼虱属(Trichodectes spp.)、毛羽虱属(Trimenopon spp.)、巨羽虱属(Trinoton spp.)、Werneckiella属;

[0331] 双翅目(Diptera)以及长角亚目(Nematocerina)和短角亚目(Brachycerina),例如伊蚊属(Aedes spp.)、按蚊属(Anopheles spp.)、黄虻属(Atylotus spp.)、蜂虱蝇属(Braula spp.)、丽蝇属(Calliphora spp.)、金蝇属(Chrysomya spp.)、斑虻属(Chrysops spp.)、库蚊属(Culex spp.)、库蠓属(Culicoides spp.)、真蚋属(Eusimulium spp.)、厩蝇

属(*Fannia* spp.)、胃蝇属(*Gasterophilus* spp.)、舌蝇属(*Glossina* spp.)、角蝇属(*Haematobia* spp.)、麻虻属(*Haematopota* spp.)、虱蝇属(*Hippobosca* spp.)、瘤虻属(*Hybomitra* spp.)、齿股蝇属(*Hydrotaea* spp.)、皮蝇属(*Hypoderma* spp.)、羊虱蝇属(*Lipoptena* spp.)、绿蝇属(*Lucilia* spp.)、罗蛉属(*Lutzomyia* spp.)、蜉蝇属(*Melophagus* spp.)、莫蝇属(*Morellia* spp.)、家蝇属(*Musca* spp.)、短蚋属(*Odagmia* spp.)、狂蝇属(*Oestrus* spp.)、*Philipomyia*属、白蛉属(*Phlebotomus* spp.)、鼻狂蝇属(*Rhinoestrus* spp.)、麻蝇属(*Sarcophaga* spp.)、蚋属(*Simulium* spp.)、螫蝇属(*Stomoxys* spp.)、虻属(*Tabanus* spp.)、大蚊属(*Tipula* spp.)、维蚋属(*Wilhelmia* spp.)、污蝇属(*Wohlfahrtia* spp.)；

[0332] 蚤目(*Siphonapterida*)，例如角叶蚤属(*Ceratophyllus* spp.)、栉头蚤属(*Ctenocephalides* spp.)、蚤属(*Pulex* spp.)、潜蚤属(*Tunga* spp.)、客蚤属(*Xenopsylla* spp.)；

[0333] 异翅目(*Heteropterida*)，例如臭虫属(*Cimex* spp.)、锥蝽属(*Panstrongylus* spp.)、红猎蝽属(*Rhodnius* spp.)、锥猎蝽属(*Triatoma* spp.)；以及来自蜚蠊目(*Blattarida*)的令人生厌的害虫和卫生害虫。

[0334] 此外，在节肢动物的情况下，应该通过示例性而非限制性的方式提及以下蜱螨亚纲(*Acari*)：

[0335] 蜱螨亚纲(*Acari*) (蜱螨目(*Acarina*)) 和后气门目(*Metastigmata*)，例如软蜱科(*Argasidae*) 如锐缘蜱属(*Argas* spp.)、钝缘蜱属(*Ornithodoros* spp.)、残喙蜱属(*Otobius* spp.)，硬蜱科(*Ixodidae*) 如花蜱属(*Amblyomma* spp.)、革蜱属(*Dermacentor* spp.)、血蜱属(*Haemaphysalis* spp.)、璃眼蜱属(*Hyalomma* spp.)、硬蜱属(*Ixodes* spp.)、扇头蜱属(*Rhipicephalus*) (牛蜱属(*Boophilus* spp.))、扇头蜱属(*Rhipicephalus* spp.) (多宿主蜱的原属)；中气门目(*Mesostigmata*) 如皮刺螨属(*Dermanyssus* spp.)、禽刺螨属(*Ornithonyssus* spp.)、肺刺螨属(*Pneumonyssus* spp.)、刺利螨属(*Raillietia* spp.)、胸刺螨属(*Sternostoma* spp.)、热厉螨属(*Tropilaelaps* spp.)、蜂螨属(*Varroa* spp.)；辐螨目(*Actinedida*) (前气门目(*Prostigmata*))，例如蜂盾螨属(*Acarapis* spp.)、姬螯螨属(*Cheyletiella* spp.)、蠕形螨属(*Demodex* spp.)、牦螨属(*Listrophorus*)、肉螨属(*Myobia* spp.)、新恙螨属(*Neotrombicula* spp.)、禽螯螨属(*Ornithocheyletia* spp.)、疮螨属(*Psorergates* spp.)、恙螨属(*Trombicula* spp.)；以及粉螨目(*Acaridida*) (无气门目(*Astigmata*))，例如粉螨属(*Acarus* spp.)、嗜木螨属(*Caloglyphus* spp.)、皮螨属(*Chorioptes* spp.)、胞螨属(*Cytodites* spp.)、颈下螨属(*Hypodectes*)、疙螨属(*Knemidocoptes* spp.)、鸡雏螨属(*Laminosioptes* spp.)、痂螨属(*Notoedres* spp.)、耳癬螨属(*Otodectes* spp.)、痒螨属(*Psoroptes* spp.)、翅螨属(*Pterolichus* spp.)、疥螨属(*Sarcoptes* spp.)、*Trixacarus*属、食酪螨属(*Tyrophagus* spp.)。

[0336] 寄生性原生动物的实例包括，但不限于：

[0337] 鞭毛纲(*Mastigophora*) (鞭毛虫纲(*Flagellata*))，例如：

[0338] 后滴虫(*Metamonada*)：双滴虫目(*Diplomonadida*)，例如贾第虫属(*Giardia* spp.)、螺旋核虫属(*Spironucleus* spp.)；

[0339] *Parabasala*：毛滴虫目(*Trichomonadida*)，例如组织滴虫属(*Histomonas* spp.)、

五鞭毛滴虫属 (*Pentatrichomonas* spp.)、四毛滴虫属 (*Tetratrichomonas* spp.)、毛滴虫属 (*Trichomonas* spp.)、三毛滴虫属 (*Tritrichomonas* spp.)；

[0340] 眼虫门 (*Euglenozoa*)：锥虫目 (*Trypanosomatida*)，例如利什曼原虫属 (*Leishmania* spp.)、锥虫属 (*Trypanosoma* spp.)；

[0341] 肉鞭毛虫亚门 (*Sarcomastigophora*) (根足虫纲 (*Rhizopoda*))，例如内阿米巴科 (*Entamoebidae*) 如内阿米巴属 (*Entamoeba* spp.)，*Centramoebidae* 如棘阿米巴属 (*Acanthamoeba* sp.)，*Euamoebidae* 如哈氏虫属 (*Harmanella* sp.)；

[0342] 囊泡虫类 (*Alveolata*)，例如顶复门 (*Apicomplexa*) (孢子虫纲 (*Sporozoa*))：例如隐孢子虫属 (*Cryptosporidium* spp.)；艾美耳球虫目 (*Eimeriida*)，例如贝诺孢子虫属 (*Besnoitia* spp.)、囊等孢虫属 (*Cystoisospora* spp.)、艾美球虫属 (*Eimeria* spp.)、哈蒙德虫属 (*Hammondia* spp.)、等孢子球虫属 (*Isospora* spp.)、新孢子虫属 (*Neospora* spp.)、肉孢子虫属 (*Sarcocystis* spp.)、弓形虫属 (*Toxoplasma* spp.)；*Adeleida* 目，例如肝簇虫属 (*Hepatozoon* spp.)、孢子球虫属 (*Klossiella* spp.)；血孢子虫目 (*Haemosporida*)，例如白细胞虫属 (*Leucocytozoon* spp.)、疟原虫属 (*Plasmodium* spp.)；梨浆虫目 (*Piroplasmida*)，例如梨浆虫属 (*Babesia* spp.)、纤毛亚门属 (*Ciliophora* spp.)、*Echinozoon* 属、泰累尔梨浆虫属 (*Theileria* spp.)；*Vesiculiferida* 目，例如小袋虫属 (*Balantidium* spp.)、布克斯顿纤毛虫属 (*Buxtonella* spp.)；

[0343] 微孢子门 (*Microspora*)，例如脑胞内原虫属 (*Encephalitozoon* spp.)、肠孢虫属 (*Enterocytozoon* spp.)、球形虫属 (*Globidium* spp.)、微孢子虫属 (*Nosema* spp.) 以及例如粘原虫门属 (*Myxozoa* spp.)。

[0344] 对人或动物致病的蠕虫，包括例如棘头虫 (*Acanthocephala*)、Nematoden、舌形动物门 (*Pentastoma*) 和扁形动物门 (*Platyhelminthes*) (例如单殖亚纲 (*Monogenea*)、绦虫 (*Cestode*) 和吸虫类 (*Trematode*))。

[0345] 说明性的蠕虫包括，但不限于：

[0346] 单殖亚纲：例如：指环虫 (*Dactylogyrus* spp.)、三代虫属 (*Gyrodactylus* spp.)、*Microbothrium* 属、多盘吸虫属 (*Polystoma* spp.)、*Troglocephalus* 属；

[0347] 绦虫：假叶目 (*Pseudophyllidea*)，例如：吸叶绦虫属 (*Bothridium* spp.)、裂头绦虫属 (*Diphyllobothrium* spp.)、复殖孔属 (*Diplogonoporus* spp.)、*Ichthyobothrium* 属、舌状绦虫属 (*Ligula* spp.)、裂头属 (*Schistocephalus* spp.)、迭宫绦虫属 (*Spirometra* spp.)；

[0348] 圆叶目 (*Cyclophyllidea*)，例如：*Andyra* 属、拟裸头绦虫属 (*Anoplocephala* spp.)、无卵黄腺绦虫属 (*Avitellina* spp.)、伯特绦虫属 (*Bertiella* spp.)、锡带绦虫属 (*Cittotaenia* spp.)、戴维绦虫属 (*Davainea* spp.)、双睾绦虫属 (*Diorchis* spp.)、复孔绦虫属 (*Diplopylidium* spp.)、犬复孔绦虫属 (*Dipylidium* spp.)、棘球绦虫属 (*Echinococcus* spp.)、棘叶绦虫属 (*Echinocotyle* spp.)、棘鳞绦虫属 (*Echinolepis* spp.)、泡尾绦虫属 (*Hydatigera* spp.)、膜壳绦虫属 (*Hymenolepis* spp.)、约优克斯绦虫属 (*Joyeuxiella* spp.)、中殖孔绦虫属 (*Mesocestoides* spp.)、蒙尼绦虫属 (*Moniezia* spp.)、副裸头绦虫属 (*Paranoplocephala* spp.)、瑞列绦虫属 (*Raillietina* spp.)、斯泰绦虫属 (*Stilesia* spp.)、带绦虫属 (*Taenia* spp.)、曲子宫绦虫属 (*Thysaniezia* spp.)、繸体

绦虫属(*Thysanosoma* spp.);

[0349] 吸虫:复殖亚纲(Digenea),例如:澳毕吸虫属(*Austroilharzia* spp.)、短咽吸虫属(*Brachylaima* spp.)、杯殖吸虫属(*Calicophoron* spp.)、下弯吸虫属(*Catantropis* spp.)、支睾吸虫属(*Clonorchis* spp.)、肛瘤吸虫属(*Collyriclum* spp.)、殖盘吸虫属(*Cotylophoron* spp.)、环腔吸虫属(*Cyclocoelum* spp.)、双腔吸虫属(*Dicrocoelium* spp.)、双穴吸虫属(*Diplostomum* spp.)、棘隙吸虫属(*Echinochasmus* spp.)、棘缘吸虫属(*Echinoparyphium* spp.)、棘口吸虫属(*Echinostoma* spp.)、阔盘吸虫属(*Eurytrema* spp.)、片形吸虫属(*Fasciola* spp.)、片形吸虫属(*Fasciolides* spp.)、姜片吸虫属(*Fasciolopsis* spp.)、菲策吸虫属(*Fischoederius* spp.)、腹袋吸虫属(*Gastrothylacus* spp.)、巨毕吸虫属(*Gigantobilharzia* spp.)、巨孔吸虫属(*Gigantocotyle* spp.)、异形吸虫属(*Heterophyes* spp.)、低颈吸虫属(*Hypoderaeum* spp.)、彩蚴吸虫属(*Leucochloridium* spp.)、后殖吸虫属(*Metagonimus* spp.)、次睾吸虫属(*Metorchis* spp.)、侏形吸虫属(*Nanophyetus* spp.)、背孔吸虫属(*Notocotylus* spp.)、后睾吸虫属(*Opisthorchis* spp.)、鸟毕吸虫属(*Ornithobilharzia* spp.)、并殖吸虫属(*Paragonimus* spp.)、同盘吸虫属(*Paramphistomum* spp.)、斜睾吸虫属(*Plagiorchis* spp.)、茎穴吸虫属(*Posthodiplostomum* spp.)、前殖吸虫属(*Prosthogonimus* spp.)、血吸虫属(*Schistosoma* spp.)、毛毕吸虫属(*Trichobilharzia* spp.)、鲑吸虫属(*Troglootrema* spp.)、盲腔吸虫属(*Typhlocoelum* spp.);

[0350] 线虫:毛形亚目(*Trichinellida*),例如:毛细线虫属(*Capillaria* spp.)、毛线虫属(*Trichinella* spp.)、*Trichomosoides*属、鞭虫属(*Trichuris* spp.);

[0351] 垫刃目(*Tylenchida*),例如:细丝鲶属(*Micronema* spp.)、*Parastrangyloides*属、粪圆线虫属(*Strongyloides* spp.);

[0352] 小杆目(*Rhabditina*),例如:猫圆线虫属(*Aelurostrongylus* spp.)、裂口线虫属(*Amidostomum* spp.)、钩虫属(*Ancylostoma* spp.)、管圆线虫属(*Angiostrongylus* spp.)、*Bronchonema*属、仰口线虫属(*Bunostomum* spp.)、夏伯特线虫属(*Chabertia* spp.)、古柏线虫属(*Cooperia* spp.)、*Cooperioides*属、环体线虫属(*Crenosoma* spp.)、盅口属(*Cyathostomum* spp.)、*Cyclococercus*属、*Cyclodontostomum*属、杯环属(*Cylicocyclus* spp.)、杯冠属(*Cylicostephanus* spp.)、柱咽属(*Cylindropharynx* spp.)、囊尾线虫属(*Cystocaulus* spp.)、网尾线虫属(*Dictyocaulus* spp.)、鹿圆线虫属(*Elaphostrongylus* spp.)、类丝虫属(*Filaroides* spp.)、球头线虫属(*Globocephalus* spp.)、细纹线虫属(*Graphidium* spp.)、辐首线虫属(*Gyaloccephalus* spp.)、血矛线虫属(*Haemonchus* spp.)、螺旋线虫属(*Heligmosomoides* spp.)、猪圆线虫属(*Hyoststrongylus* spp.)、马歇尔线虫属(*Marshallagia* spp.)、后圆线虫属(*Metastrongylus* spp.)、缪勒线虫属(*Muellerius* spp.)、板口线虫属(*Necator* spp.)、细颈线虫属(*Nematodirus* spp.)、新圆线虫属(*Neoststrongylus* spp.)、日本圆线虫属(*Nippostrongylus* spp.)、尖柱线虫属(*Obeliscooides* spp.)、食道齿属(*Oesophagodontus* spp.)、结节线虫属(*Oesophagostomum* spp.)、盘头线虫属(*Ollulanus* spp.);鸟圆线虫属(*Ornithostrongylus* spp.)、奥斯勒线虫属(*Oslerus* spp.)、胃线虫属(*Ostertagia* spp.)、副库柏属(*Paracooperia* spp.)、*Paracrenosoma*属、副类丝虫属(*Parafilaroides* spp.)、拟马鹿圆线虫属

(*Parelaphostrongylus* spp.)、肺尾属(*Pneumocaulus* spp.)、肺圆线虫属(*Pneumostrongylus* spp.)、杯口线虫属(*Poteriostomum* spp.)、原圆线虫属(*Protostrongylus* spp.)、尖尾线虫属(*Spicocaulus*)、冠尾线虫属(*Stephanurus* spp.)、圆线虫属(*Strongylus* spp.)、开口虫属(*Syngamus* spp.)、背带线虫属(*Teladorsagia* spp.)、毛线线虫属(*Trichonema* spp.)、毛圆线虫属(*Trichostrongylus* spp.)、三齿线虫属(*Triodontophorus* spp.)、隐圆线虫属(*Troglostrongylus* spp.)、钩虫属(*Uncinaria* spp.)；

[0353] 旋尾目(*Spirurida*)，例如：棘唇线虫属(*Acanthocheilonema* spp.)、异尖线虫属(*Anisakis* spp.)、禽蛔虫属(*Ascaridia* spp.)；蛔虫属(*Ascaris* spp.)、斜环咽线虫属(*Ascarops* spp.)、无刺线虫属(*Aspiculuris* spp.)、贝利蛔线虫属(*Baylisascaris* spp.)、布鲁线虫属(*Brugia* spp.)、*Cercopithifilaria*属、*Crassicauda*属、棘唇属(*Dipetalonema* spp.)、恶丝虫属(*Dirofilaria* spp.)、龙线虫属(*Dracunculus* spp.)；德拉西线虫属(*Draschia* spp.)、蛲虫属(*Enterobius* spp.)、丝虫属(*Filaria* spp.)、颚口线虫属(*Gnathostoma* spp.)、筒线虫属(*Gongylonema* spp.)、丽线虫属(*Habronema* spp.)、异刺线虫属(*Heterakis* spp.)；光丝虫属(*Litomosoides* spp.)、罗阿丝虫属(*Loa* spp.)、盘尾丝虫属(*Onchocerca* spp.)、尖尾线虫属(*Oxyuris* spp.)、副柔线属(*Parabronema* spp.)、副丝虫属(*Parafilaria* spp.)、副蛔虫属(*Parascaris* spp.)、栓尾线虫属(*Passalurus* spp.)、泡翼线虫属(*Physaloptera* spp.)、普氏线虫属(*Probstmayria* spp.)、*Pseudofilaria*属、腹腔丝虫属(*Setaria* spp.)、*Skjrabinema*属、旋毛线虫属(*Spirocerca* spp.)、冠丝虫属(*Stephanofilaria* spp.)、圆线虫属(*Strongyluris*)、管状线虫属(*Syphacia* spp.)、吸吮线虫属(*Thelazia* spp.)、弓蛔线虫属(*Toxascaris* spp.)、弓蛔虫属(*Toxocara* spp.)、吴策线虫属(*Wuchereria* spp.)；

[0354] 棘头动物门(*Acanthocephala*)：寡棘吻目(*Oligacanthorhynchida*)，例如：巨吻丝虫属(*Macracanthorhynchus* spp.)、前睾棘头虫属(*Prosthenorchis* spp.)；念珠目(*Moniliformida*)，例如：念珠棘虫属(*Moniliformis* spp.)；

[0355] 多形目(*Polymorphida*)，例如：细颈棘头虫属(*Filicollis* spp.)；棘吻目(*Echinorhynchida*)，例如棘头虫属(*Acanthocephalus* spp.)、鱼棘头虫属(*Echinorhynchus* spp.)、鳞棘头虫属(*Leptorhynchoides* spp.)；

[0356] 舌形动物门(*Pentastoma*)：舌形虫目(*Porocephalida*)，例如舌形虫属(*Linguatula* spp.)。

[0357] 在兽医领域和动物饲养中，通过本领域通常已知的方法，例如通过肠内、胃肠外、皮肤或鼻腔以合适制剂的形式施用式(I)的化合物。施用可为预防性的、补救性的(*metaphylactic*)或治疗性的。

[0358] 因此，本发明的一个实施方案涉及用作药物的式(I)化合物。

[0359] 另一方面涉及用作抗内寄生虫剂的式(I)化合物。

[0360] 本发明的另一特定方面涉及用作抗蠕虫剂的式(I)化合物，特别用作杀线虫剂、杀扁形动物剂(*platyhelminthicide*)、杀棘头动物剂(*acanthocephalicide*)或杀舌形动物剂(*pentastomicide*)。

[0361] 本发明的另一特定方面涉及用作抗原生动物剂的式(I)化合物。

[0362] 另一方面涉及用作抗外寄生虫剂,特别是杀节肢动物剂,非常特别是杀虫剂或杀螨剂的式(I)化合物。

[0363] 本发明的其他方面是兽用药物制剂,其包含有效量的至少一种式(I)的化合物和至少一种以下物质:药学上可接受的赋形剂(例如固体或液体稀释剂)、药学上可接受的助剂(例如表面活性剂),特别是常规用于兽用药物制剂的药学上可接受的赋形剂和/或常规用于兽用药物制剂的药学上可接受的助剂。

[0364] 本发明的相关方面制备如本文所述的兽用药物制剂的方法,包括以下步骤:将至少一种式(I)的化合物与药学上可接受的赋形剂和/或助剂、特别是与常规用于兽用药物制剂的药学上可接受的赋形剂和/或常规用于兽用药物制剂的助剂混合。

[0365] 本发明的另一特定方面为兽用药物制剂及其制备方法,根据所述方面,所述兽用药物制剂选自杀外寄生虫剂和杀内寄生虫剂,尤其选自抗蠕虫剂、抗原生动物剂和杀节肢动物剂,非常特别地选自杀线虫剂、杀扁形虫剂、杀棘头虫剂、杀舌形虫剂、杀虫剂和杀螨剂。

[0366] 另一方面涉及一种通过在有需要的动物、特别是非人类动物中使用有效量的式(I)的化合物来处理寄生虫感染、特别是由选自本文提及的外寄生虫和内寄生虫的寄生虫引起的感染的方法。

[0367] 另一方面涉及一种通过在有需要的动物、特别是非人类动物中使用如本文所定义的兽用药物制剂来治疗寄生虫感染、特别是由选自本文提及的外寄生虫和内寄生虫的寄生虫引起的感染的方法。

[0368] 另一方面涉及式(I)的化合物在处理动物、特别是非人类动物中的寄生虫感染、特别是由选自本文提及的外寄生虫和内寄生虫的寄生虫引起的感染的用途。

[0369] 在本发明上下文的动物健康或兽医学中,术语“处理”包括预防性的、补救性的和治疗性的处理。

[0370] 在具体的实施方案中,以此方式,提供至少一种式(I)的化合物与其他活性化合物、特别是与杀内寄生虫剂和杀外寄生虫剂的混合物以用于兽医学领域。

[0371] 在动物健康领域中,“混合物”不仅指两种(或多种)不同的活性成分配制为常规制剂并相应地一起使用,而且还涉及包含各个活性成分分开的制剂产品。因此,当要使用两种以上的活性成分时,可将所有活性成分配制成常规制剂,或者可以将所有活性成分配制成单独制剂;同样可想到的是其中一些活性成分一起成剂并且一些活性成分单独成剂的混合形式。单独的制剂允许分开或连续施用所述活性成分。

[0372] 在本文中以其“通用名称”指定的活性化合物是已知的,并且记载于例如“农药手册(Pesticide Manual)”(见上文)中,或者可以在互联网(例如:<http://www.alanwood.net/pesticides>)上检索到。

[0373] 作为混合组分的杀外寄生虫剂的说明性并非旨在构成限制的活性成分包括上面详细列出的杀虫剂和杀螨剂。基于目前的IRAC模式的作用分类表的上述分类,列出以下其他可用的活性成分:(1)乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂;(2)GABA门控氯离子通道阻滞剂;(3)钠通道调节剂;(4)烟碱乙酰胆碱受体(nAChR)竞争性调节剂;(5)烟碱乙酰胆碱受体(nAChR)变构调节剂;(6)谷氨酸门控氯化物通道(GluCl)变构调节剂;(7)保幼激素模仿物;(8)各种非特异性(多位点)抑制剂;(9)脊索器官调节剂;(10)螨生长抑制剂;(12)线粒体

ATP合成酶抑制剂,如ATP干扰剂;(13)中断质子梯度的氧化磷酸化的解偶联剂;(14)烟碱乙酰胆碱受体通道阻滞剂;(15)0型几丁质生物合成抑制剂;(16)1型几丁质生物合成抑制剂;(17)蜕皮干扰剂(特别是在双翅目(Diptera)的情况下);(18)蜕皮激素受体激动剂;(19)章鱼胺受体激动剂;(21)线粒体复合物I型电子转移抑制剂;(25)线粒体复合物II型电子转移抑制剂;(20)线粒体复合物III型电子转移抑制剂;(22)电压依赖性钠通道阻滞剂;(23)乙酰辅酶A羧化酶抑制剂;(28)兰尼碱受体调节剂;

[0374] 具有未知或非特异性作用机制的活性成分,例如氟硝二苯胺(fentrifanil)、fenoxacrim、cycloprene、乙酯杀螨醇、杀虫脒、氟苯灭(flubenzimin)、地昔尼尔(dicyclanil)、磺胺螨酯(amidoflumet)、灭螨猛(quinomethionat)、苯螨嗪(triarathene)、clothiazoben、杀螨硫醚(tetrasul)、油酸钾、石油、噁虫酮、gossyplur、氟螨嗪(flutenzine)、溴螨酯(brompropylate)、冰晶石;

[0375] 其他类的化合物,例如畜虫威、敌蝇威、除线威、磷虫威(phosphocarb)、噻啉磷(-乙基)、对硫磷(-乙基)、虫螨畏、邻水杨酸异丙酯、敌百虫、硫丙磷、丙虫磷、克线丹(sebufos)、啞硫磷(pyridathion)、发硫磷、除线磷、磺吸磷(demeton-S-methyl sulphone)、氯唑磷(isazofos)、苯腈磷、氯亚胺硫磷、三硫磷(carbophenothion)、autathiofos、aromfenvinfos(-甲基)、谷硫磷(-乙基)、毒死蜱(-乙基)、丁苯硫磷、碘硫磷、蔬果磷、安果磷、地虫硫磷、吡氟硫磷(flupyrazofos)、丰索磷、乙噻硫磷;

[0376] 有机氯化物,例如毒杀芬、林丹、七氯;或苯基吡啶类,例如乙酰虫腈(acetoprole)、啞吡啶虫胺(pyrafluprole)、吡啶虫啉(pyriprole)、氟吡啶虫(vaniliprole)、维吉霉素(sisapronil);或异噁唑啉,例如sarolaner、阿福拉纳(afoxolaner)、lotilaner、氟雷拉纳(fluralaner);

[0377] 拟除虫菊酯,例如顺-甲氧苄氟菊酯和反-甲氧苄氟菊酯(metofluthrin)、丙氟菊酯、三氟醚菊酯(flufenprox)、溴氟菊酯(flubrocycythrinate)、fubfenprox、五氟苯菊酯(fenfluthrin)、protrifenbut、反灭虫菊(pyresmethrin)、RU15525、环戊烯丙菊酯、顺-苄呋菊酯、庚氟菊酯(heptafluthrin)、戊环苄呋菊酯(bioethanomethrin)、生物氯菊酯、吡氯氰菊酯、顺-氯氰菊酯、顺-苄氯菊酯、氯氟氰菊酯(clocythrins)、氯氟氰菊酯(λ -)(cyhalothrin(λ -))、二氯炔戊菊酯或卤代烃化合物(HCH);

[0378] 新烟碱类,例如硝虫噻嗪(nithiazine);

[0379] Dicloromezotiaz,三氟苯噻啉(triflumezopyrim);

[0380] 大环内酯类,例如奈马克丁(nemadectin)、伊维菌素(ivermectin)、拉替菌素(latidectin)、莫西菌素(moxidectin)、塞拉菌素(selamectin)、依立诺克丁(eprinomectin)、多拉菌素(doramectin)、埃玛菌素(emamectin benzoate);米尔倍霉素肟(milbemycin oxime);

[0381] 烯虫硫酯(triprene)、保幼醚(epofenonane)、苯虫醚(diufenolan);

[0382] 生物制剂类、激素类或信息素类,例如天然产物,例如苏云金素(thuringiensin)、苹果小卷蛾性诱剂(codlemone)或印度楝(neem)组分;

[0383] 二硝基苯酚类,例如敌螨普(dinocap)、敌螨通(dinobuton)、乐杀螨(binapacryl);

[0384] 苯甲酰脲类,例如氟啉啉脲(fluzuron)、氟幼脲(penfluron);

- [0385] 脘衍生物类,例如chlormebuform、螞蟧胺、得米地曲;
- [0386] 蜂蟻杀蟻剂(beehive varroa acaricide),例如有机酸类,例如甲酸、草酸。
- [0387] 作为混合组分的杀内寄生虫类的说明性活性成分,包括但不限于,活性抗蟻虫成分和活性抗原生动物成分。
- [0388] 抗蟻虫活性化合物包括但不限于以下杀线虫、杀吸虫(trematocidal)和/或杀绦虫活性化合物:
- [0389] 大环内酯类,例如:依立诺克丁(epinomectin)、阿维菌素(abamectin)、奈马克丁(nemadectin)、莫西菌素(moxidectin)、多拉菌素(doramectin)、塞拉菌素(selamectin)、雷皮菌素(lepimectin)、拉替菌素(latidectin)、灭蟻菌素(milbemectin)、伊维菌素(ivermectin)、依马菌素(emamectin)、米尔倍霉素(milbemycin);
- [0390] 苯并咪唑类和苯并咪唑类前体,例如:奥苯达唑(oxibendazole)、甲苯达唑(mebendazole)、三氯苯达唑(triclabendazole)、托布津(thiophanate)、帕苯达唑(parbendazole)、奥芬达唑(oxfendazole)、奈托比胺(netobimin)、芬苯达唑(fenbendazole)、苯硫氨酯(febantel)、噻苯达唑(thiabendazole)、环苯达唑(cyclobendazole)、坎苯达唑(cambendazole)、阿苯达唑亚砷(albendazole sulfoxide)、阿苯达唑(albendazole)、氟苯达唑(flubendazole);
- [0391] 缩肽类,优选环状缩肽类,特别是24元环状缩肽类,例如:依吗德塞(emodepside)、PF1022A;
- [0392] 四氢嘧啶类,例如甲噻嘧啶(morantel)、噻嘧啶(pyrantel)、奥克太尔(oxantel);
- [0393] 咪唑并噻唑类,例如布他米唑(butamisol)、左旋咪唑(levamisole)、四咪唑(tetramisol);
- [0394] 氨基苯基脘类,例如:阿米登太(amidantel)、脱酰基的阿米登太(dAMD)、三苯双脘;
- [0395] 氨基乙脘类,例如:莫奈太尔(monepantel);
- [0396] parahequamide类,例如:paraherquamide、得曲恩特(derquantel);
- [0397] 水杨酰苯胺类,例如:三溴水杨酰苯胺(tribromsalan)、溴沙尼特(bromoxanide)、溴替尼特(brotianide)、氯碘沙尼(cloxanide)、氯生太尔(closantel)、氯硝柳胺(niclosamide)、羟氯扎胺(oxyclozanide)、雷复尼特(rafoxanide);
- [0398] 取代的苯酚类,例如:硝碘酚脘(nitroxynil)、硫氯酚(bithionol)、二碘硝酚(disophenol)、六氯酚(hexachlorophene)、硝氯酚(niclofolan)、联硝氯酚(meniclopholan);
- [0399] 有机磷酸酯类,例如:敌百虫(trichlorfon)、驱虫磷(naphthalofos)、敌敌畏(dichlorvos/DDVP)、育畜磷(crufomate)、蝇毒磷(coumaphos)、哈洛克酮(haloxone);
- [0400] 哌嗪酮/喹啉类,例如:吡喹酮(praziquantel)、依西太尔(epsiprantel);
- [0401] 哌嗪类,例如:哌嗪、羟哌;
- [0402] 四环素类,例如:四环素、氯四环素、多西环素(doxycycline)、氧四环素(oxytetracycline)、吡甲四环素(rolitetracycline);
- [0403] 各种其他种类,例如:丁萘脘(bunamidine)、尼立达唑(niridazole)、雷琐太尔(resorantel)、omphalotin、奥替普拉(oltipraz)、硝硫氰酯(nitroscanate)、硝碘酚脘

(nitroxynil)、奥沙尼喹(oxamniquin)、mirasan、miracil、硫坎酮(lucanthon)、海恩酮(hycanthon)、三氯苯哌嗪(hetolin)、依米丁(emetin)、乙胺嗪(diethylcarbamazine)、双氯酚(dichlorophen)、联胺苯醚(diamfenetide)、氯硝安定(clonazepam)、酚乙铵(bephenium)、硝硫氰胺(amoscanate)、氯舒隆(clorsulon)。

[0404] 活性抗原动物成分包括但不限于以下活性成分:

[0405] 三嗪类,例如:地克珠利(diclazuril)、泊那珠利(ponazuril)、来曲珠利(letrazuril)、托曲珠利(toltrazuril);

[0406] 聚醚离子载体类,例如:莫能菌素(monensin)、盐霉素、马杜霉素(maduramicin)、甲基盐霉素(narasin);

[0407] 大环内酯类,例如:米尔倍霉素(milbemycin)、红霉素(erythromycin);

[0408] 喹诺酮类,例如:恩氟沙星(enrofloxacin)、普多沙星(pradofloxacin);

[0409] 奎宁类,例如:氯喹(chloroquin);

[0410] 嘧啶类,例如:乙胺嘧啶(pyrimethamine);

[0411] 磺酰胺类,例如:磺胺喹啉(sulfaquinoxaline)、三甲氧苄氨嘧啶(trimethoprim)、sulfaclozin;

[0412] 硫胺(thiamine)类,例如:安普罗铵(amprolium);

[0413] 林可酰胺(lincosamide)类,例如:克林霉素(clindamycin);

[0414] 碳酰苯胺(carbanilide)类,例如:咪多卡(imidocarb);

[0415] 硝基呋喃(nitrofurans)类,例如:硝呋替莫(nifurtimox);

[0416] 喹啉酮生物碱类,例如:卤夫酮(halofuginone);

[0417] 各种其他种类,例如:奥沙尼喹(oxamniquin)、巴龙霉素(paromomycin);

[0418] 疫苗类或微生物抗原,例如:罗氏犬巴贝斯虫(*Babesia canis rossi*)、柔嫩艾美耳球虫(*Eimeria tenella*)、早熟艾美耳球虫(*Eimeria praecox*)、扁嘴艾美耳球虫(*Eimeria necatrix*)、和缓艾美耳球虫(*Eimeria mitis*)、巨型艾美耳球虫(*Eimeria maxima*)、布氏艾美耳球虫(*Eimeria brunetti*)、堆形艾美耳球虫(*Eimeria acervulina*)、韦氏犬巴贝斯虫(*Babesia canis vogeli*)、婴儿利什曼原虫(*Leishmania infantum*)、犬巴贝斯虫(*Babesia canis canis*)、胎生网尾线虫(*Dictyocaulus viviparus*)。

[0419] 如果可以,所提及的所有混合组分也可以与合适的碱或酸形成盐,条件是它们基于其官能团能够与合适的碱或酸形成盐。

[0420] 病媒防治

[0421] 式(I)的化合物还可用于病媒防治。在本发明的上下文中,病媒为能够将病原体例如病毒、蠕虫、单细胞生物和细菌从贮主(植物、动物、人等)传播给宿主的节肢动物,尤其是昆虫或蛛形纲动物。所述病原体可被机械地传播到宿主(例如通过非叮咬(non-stinging)蝇传播沙眼)上,或者可以在注射到宿主中后传播给宿主(例如通过蚊子传播疟原虫)。

[0422] 病媒以及它们传播的疾病或病原体的实例为:

[0423] 1) 蚊

[0424] -按蚊:疟疾、丝虫病;

[0425] -库蚊:日本脑炎、丝虫病、其他病毒性疾病、传播其他蠕虫;

[0426] -伊蚊:黄热病、登革热、其他病毒性疾病、丝虫病;

- [0427] - 蚋科: 传播蠕虫, 特别是盘尾丝虫 (*Onchocerca volvulus*);
- [0428] - 毛蠓科: 传播利什曼病
- [0429] 2) 虱: 皮肤感染、流行性斑疹伤寒 (epidemic typhus);
- [0430] 3) 跳蚤: 鼠疫、地方性斑疹伤寒、绦虫;
- [0431] 4) 蝇: 昏睡病 (锥虫病 (trypanosomiasis))、霍乱、其他细菌性疾病;
- [0432] 5) 螨: 壁虱病、流行性斑疹伤寒、立克次氏体痘、土拉菌病、圣路易斯脑炎 (Saint Louis encephalitis)、蜱媒脑炎 (tick-borne encephalitis) (TBE)、克里米亚-刚果出血热 (Crimean-Congo haemorrhagic fever)、疏螺旋体病 (borreliosis);
- [0433] 6) 蜱: borellioses, 如伯氏疏螺旋体 (*Borrelia burgdorferi sensu lato*)、达氏疏螺旋体 (*Borrelia duttoni*)、蜱媒脑炎、Q热 (贝氏柯克斯体 (*Coxiella burnetii*))、巴贝斯虫病 (babesioses) (犬巴贝斯虫 (*Babesia canis canis*))、埃里希体病 (ehrlichiosis)。
- [0434] 在本发明的上下文中, 病媒的实例为可向植物传播植物病毒的昆虫, 例如蚜虫、蝇、叶蝉或蓟马 (thrip)。能够传播植物病毒的其他病媒是蛛螨、虱、甲虫和线虫。
- [0435] 在本发明的上下文中, 病媒的其他实例为可向动物和/或人类传播病原体昆虫和蛛形纲动物, 例如蚊, 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) 以及库蚊属, 毛蠓科例如白蛉属、罗蛉属, 虱, 跳蚤, 蝇, 螨和蜱。
- [0436] 如果式 (I) 的化合物为破坏抗性 (resistance-breaking) 的, 则病媒防治也是可能的。
- [0437] 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, 本发明的另一方面为式 (I) 的化合物在例如农业、园艺、林业、园林以及休闲设施中、以及在材料和贮存产品的保护中用于病媒防治的用途。
- [0438] 工业材料保护
- [0439] 式 (I) 的化合物适用于保护工业材料免受昆虫的侵袭或破坏, 所述昆虫例如来自鞘翅目 (Coleoptera)、膜翅目 (Hymenoptera)、等翅目 (Isoptera)、鳞翅目 (Lepidoptera)、啮虫目 (Psocoptera) 和衣鱼目 (Zygentoma)。
- [0440] 在本发明的上下文中, 工业材料应理解为意指无生命材料, 例如优选塑料、粘合剂、胶料、纸和卡片、皮革、木材及加工的木制品和涂布组合物。特别优选本发明用于保护木材的用途。
- [0441] 在另一实施方案中, 式 (I) 的化合物与至少一种其他杀虫剂和/或至少一种杀真菌剂一起使用。
- [0442] 在另一实施方案中, 式 (I) 的化合物呈即用型 (ready-to-use) 农药的形式, 意味着它不可以不经进一步改性而应用到所述材料上。有用的其他杀虫剂或杀真菌剂特别包括上述提及的那些杀虫剂或杀真菌剂。
- [0443] 出人意料地, 还发现式 (I) 的化合物可用于保护与盐水或微咸水接触的物体免受污染, 尤其是船体、筛、网、建筑物、系泊设备及信号系统。同样可以将式 (I) 的化合物单独或与其他活性化合物结合用作防污剂。
- [0444] 卫生领域中动物害虫的防治
- [0445] 式 (I) 的化合物适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、卫生保护领域以及储存产品的保护中,特别是用于防治在密闭空间例如住所、工厂车间、办公室、车辆舱室、动物饲养设施中遇到的昆虫、蛛形纲动物、蜱和螨。为了防治动物害虫,将式(I)的化合物单独使用或与其他活性化合物和/或助剂结合使用。其优选用于家用杀虫剂产品中。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。

[0446] 这些害虫包括例如以下害虫:蛛形纲(Arachnida),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(Phthiraptera)、啮虫目、跳跃目(Saltatoria)或直翅目、蚤目和衣鱼目;以及软甲纲,等足目。

[0447] 以下列形式进行施用:气雾剂、无压喷雾产品如泵式喷雾剂和雾化喷雾剂、自动雾化体系、雾化剂、泡沫剂、凝胶剂、具有由纤维素或塑料制成的蒸发片剂(evaporator tablet)的蒸发产品、液体蒸发剂、凝胶和薄膜蒸发剂、推进器驱动的蒸发器、无动力(energy-free)或无源(passive)的蒸发体系、捕蛾纸、捕蛾袋和捕蛾胶,作为颗粒剂或粉剂,用于撒播的诱饵或诱饵站(bait station)中。

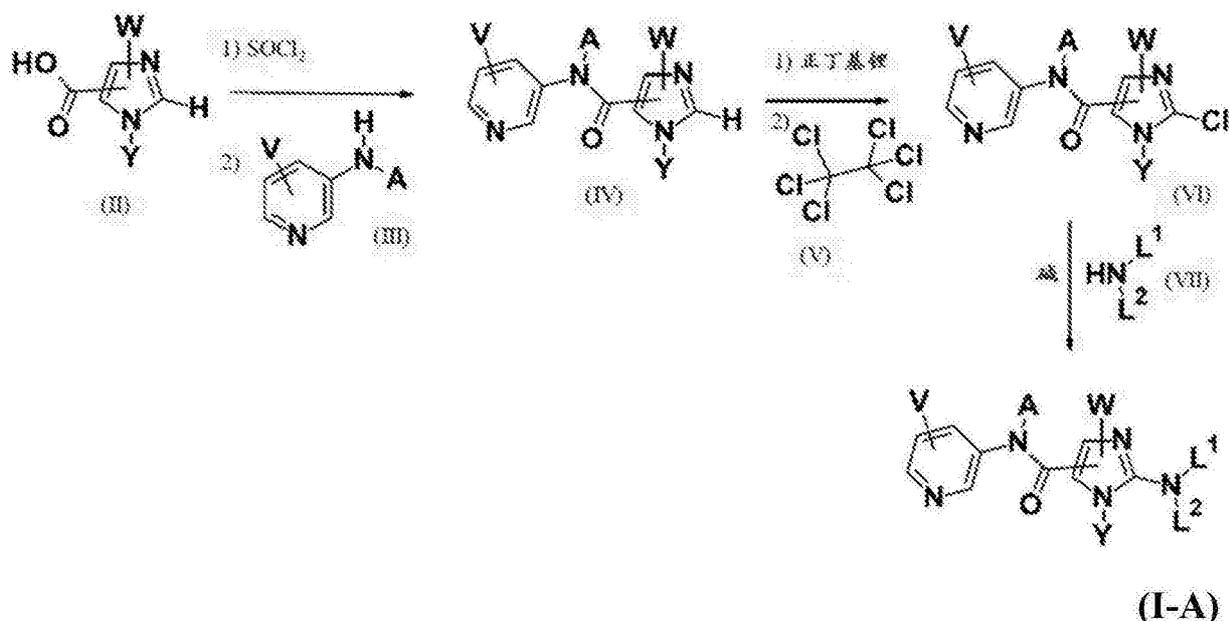
[0448] 方法和中间体的描述

[0449] Q代表氧的式(I-A)的化合物可以例如通过方案1中所示的方法合成。Q代表硫的式(I-B)的化合物可以例如根据方案2由式(I-A)的化合物获得。在方案1和方案2中所示的方法中,除非另有说明,否则在每种情况下在式中使用的基W、Y、V、A、L¹和L²具有在优选范围(1)至(5)中给出的含义。

[0450] 式(I-A)的化合物可以如方案1中所示,通过首先使式(II)的咪唑羧酸与式(III)的氨基吡啶反应生成式(IV)的化合物(参见酰胺化方法)来合成。然后,类似于已知方法,在低温(例如,-75°C至-100°C)下在溶剂如四氢呋喃或二乙醚中,用强碱例如正丁基锂、二异丙胺锂或叔丁醇锂将式(IV)的化合物去质子化,然后与氯化剂例如式(V)的六氯乙烷反应,得到式(VI)的氯代咪唑(参见EP1988081;US20050250948)。然后,式(VI)的氯代咪唑可以与式(VII)的氮亲核试剂反应,得到式(I-1)的化合物。在本文中,式(VII)的化合物可任选地使用碱去质子化。可以举例提及的碱是:氢氧化钾、叔丁醇钾、三乙胺,以及所有常规的无机碱或有机碱,例如有机胺,如二异丙基乙胺、N-甲基吗啉、吡啶或N,N-二甲基氨基吡啶,碱金属碳酸盐和碱土金属碳酸盐如碳酸锂、碳酸钠、碳酸钾或碳酸铯,碱金属碳酸氢盐如碳酸氢钠或碳酸氢钾。对于通过各种氨基化合物取代咪唑2-位的氯原子,许多反应条件已经有所记载(参见,例如,US2005250948;W02010144338;Jablonski,J.A.et al., Bioorg.Med.Chem.Lett.2009,19,903-907;US2009186879)。

[0451] 方案1

[0452]



[0453] 方法所需的式(II)的咪唑基羧酸市售可得,或者可以例如通过由文献已知的方法来制备,例如:H.Rapoport et.al.;Synthesis 1988,10,767-771;BASF Aktiengesellschaft专利:US4864030A1,1989;Takeda Pharmaceutical Company Limited专利:EP2530078A1,2012;TAISHO PHARMACEUTICAL CO.,LTD.专利:US2012/10414 A1,2012;Subrayan,Ramachandran P.;Thurber,Ernest L.;Rasmussen,Paul G.Tetrahedron,1994,50,2641-2656。

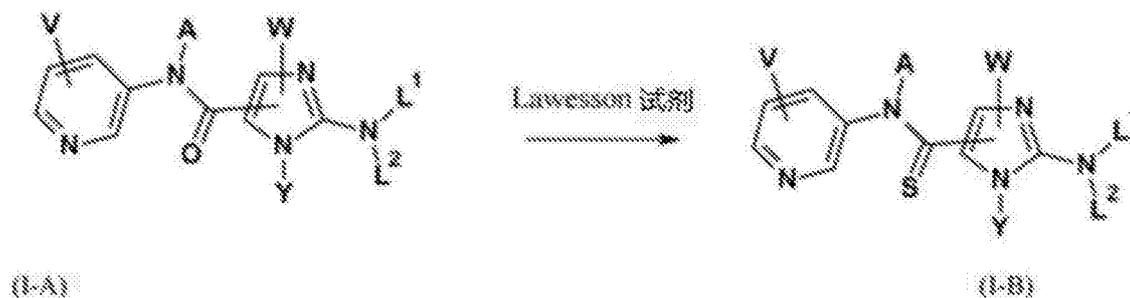
[0454] 方法所需的式(III)的3-氨基吡啶市售可得,或者可以例如通过由文献已知的方法来制备,例如:Liu,Zhen-Jiang;Vors,Jean-Pierre;Gesing,Ernst R.F.;Bolm,Carsten,Advanced Synthesis and Catalysis,2010,352,3158-3162;BAYER CROPSCIENCE AG专利:US2010/305124 A1,2010;Shafir,Alexandr;Buchwald,Stephen L.,Journal of the American Chemical Society,2006,128,8742-8743。

[0455] 方法所需的式(VIII)的NH化合物(例如烷基胺、二烷基胺、环胺、胍、吡啶、咪唑、三唑等)市售可得,或者可通过有机化学中已知的一般方法来制备。

[0456] 式(I-B)的硫代酰胺可以如方案2中所示,通过使式(I-A)的化合物与硫化剂如五硫化二磷或Lawesson试剂类似于通常已知的方法进行反应来合成(参见,例如C.P.Dell in Comprehensive Organic Functional Group Transformations,Vol.5,Ed.:A.R.Katritzky,O.Meth-Cohn,C.W.Rees,Pergamon,Oxford,1995,S.565-628;M.Jesberger,T.P.Davis,L.Barner,Synthesis 2003,13,1929)。

[0457] 方案2

[0458]



[0459] 酰胺化方法

[0460] 在本发明的方法中,式(IV)的化合物可使用由文献已知或与所明确提及的实施例类似的酰胺化反应来合成。

[0461] 对于酰胺化步骤,许多反应条件已经有所记载,例如G.Benz在Comprehensive Organic Synthesis,1st Ed.,Pergamon Press,Oxford,1991,Vol.6,pp.381-417中记载的;P.D.Bailey等人在Comprehensive Organic Functional Group Transformation,1st Ed.,Elsevier Science Ltd.,Oxford,1995,Vol.5,pp.257-308中记载的,以及R.C.Larock在Comprehensive Organic Transformations,2nd Ed.,Wiley-VCH,New York,Weinheim,1999,pp.1929-1994中记载的。这些反应的一些通过中间体碳酰氯进行,所述碳酰氯可以以单独形式或以原位生成的形式使用。

[0462] 酰胺化反应任选在缩合剂存在下、任选在酸受体存在下以及任选在溶剂存在下进行。

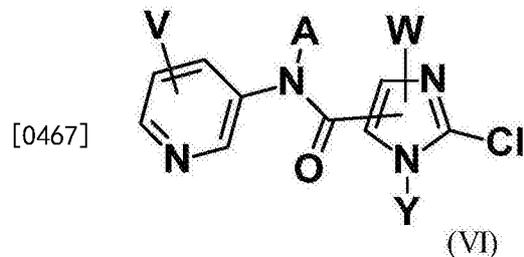
[0463] 有用的缩合剂是通常可用于该酰胺化反应的所有缩合剂。实例包括:活化剂,如光气、三氯化磷、氧氯化磷、草酰氯、草酰溴或亚硫酰氯;碳二亚胺,如N,N'-二环己基碳二亚胺(DCC)和1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳二亚胺(EDCI);或其他常规缩合剂,如五氧化磷、多磷酸、N,N'-羰基二咪唑、2-氯吡啶1-甲碘化物(Mukaiyama试剂)、2-乙氧基-N-乙氧基羰基-1,2-二氢喹啉(EEDQ)、三苯基磷/四氯化碳、溴代三吡咯烷六氟磷酸盐(BROP)、0-(1H-苯并三唑-1-基)三(二甲基氨基)六氟磷酸盐(BOP)、N,N,N',N'-双(四亚甲基)脲四氟硼酸盐(N,N,N',N'-bis(tetramethylene)chlorouronium tetrafluoroborate)、0-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲六氟磷酸盐(HBTU)、0-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-双(四亚甲基)脲六氟磷酸盐、0-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲四氟硼酸盐(TBTU)、0-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-双(四亚甲基)脲四氟硼酸盐、0-(7-氮杂苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲六氟磷酸盐(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-甲基吗啉盐(DMT.MM),通常可作为氯化物获得。这些试剂可以单独使用或结合使用。

[0464] 合适的酸受体是所有常规的无机碱或有机碱,例如:有机胺,如三乙胺、二异丙基乙胺、N-甲基吗啉、吡啶或N,N-二甲基氨基吡啶;碱金属和碱土金属碳酸盐,如碳酸锂、碳酸钠、碳酸钾或碳酸铯;碱金属碳酸氢盐,如碳酸氢钠或碳酸氢钾。在本发明的方法中,酰胺化反应任选地在合适的反应助剂的存在下进行,所述反应助剂例如,N,N-二甲基甲酰胺或N,N-二甲基氨基吡啶。合适的溶剂或稀释剂是所有的惰性有机溶剂,例如脂族烃或芳族烃(例如石油醚、甲苯、环己烷)、卤代烃(例如氯甲苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、1,2-二氯乙烷)、醚(例如二乙醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷)、酯(例如乙酸乙酯或乙酸甲酯)、硝基

烃类(例如硝基甲烷、硝基乙烷、硝基苯)、腈(例如乙腈、丙腈、丁腈、苄腈)、酰胺类(例如N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基甲酰苯胺、N-甲基吡咯烷酮、六甲基磷酰胺),以及二甲基亚砷或水以及所述溶剂的混合物。

[0465] 还可以使用混合酸酐来制备式(III)的化合物(参见J. Am. Chem. Soc. 1967, 5012)。在该方法中,可以使用氯甲酸酯,例如氯甲酸甲酯、氯甲酸乙酯、氯甲酸异丁酯和氯甲酸异丙酯。同样地,为此还可以使用二乙基乙酰氯、三甲基乙酰氯和类似的化合物。

[0466] 本发明还提供了式(VI)的中间体,



[0468] 其中基团具有优选范围(1-1)至(5-1)或(1-2)至(5-2)之一所述的含义,特别优选优选范围(5-1)或(5-2)所述的含义。

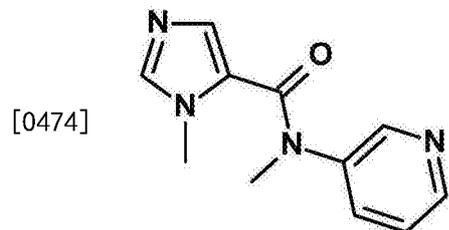
[0469] 制备实施例

[0470] 以下制备和用途实施例阐明本发明,并非限制本发明。

[0471] 合成实施例1

[0472] N,1-二甲基-N-(吡啶-3-基)-2-[3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1H-咪唑-5-羧酰胺(化合物编号I-1-007)

[0473] 步骤1:N,1-二甲基-N-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-5-羧酰胺

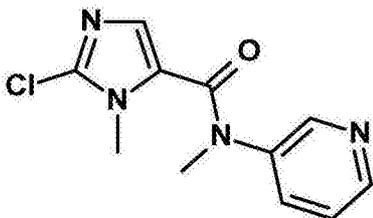


[0475] 将12.71g(104.7mmol)亚硫酸氯加入到12g(95.2mmol)1-甲基咪唑-5-羧酸在72ml甲苯中的悬浮液中,将混合物在130℃下搅拌过夜。减压浓缩反应混合物。向残余物中加入10.3g(95.2mmol)3-甲基氨基吡啶在72ml吡啶中的溶液,并将所得反应混合物在115℃下加热4h。然后将混合物再次减压浓缩,并通过使用流动相乙腈/甲醇3:1的硅胶柱色谱纯化残余物。这得到8.1g(理论值的39.3%)标题化合物和9.5g(理论值的37.1%)标题化合物的HCl盐。

[0476] HPLC-MS:logP[n]=0,44;mass(m/z):217,1;1H-NMR(CD3CN,400MHz);δ=3.39(s,3H),3.81(s,3H),6.17(s,1H),7.36-7.40(m,2H),7.67-7.70(m,1H),8.41(m,1H)8.47(m,1H)ppm。

[0477] 步骤2:2-氯-N,1-二甲基-N-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-5-羧酰胺

[0478]

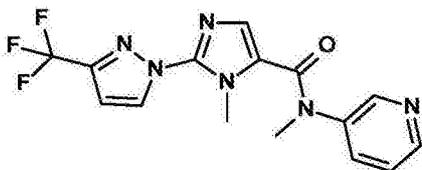


[0479] 将10.0g (46.2mmol) N,1-二甲基-N-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-5-羧酰胺溶解在150ml 无水THF中并冷却至-78℃。在5分钟时间内逐滴加入20.34ml (50.8mmol) 2.5M的正丁基锂溶于的正己烷溶液,并将混合物在-78℃下再搅拌30分钟。然后在5分钟内逐滴加入12.0g (50.8mmol) 六氯乙烷溶于100ml THF中的溶液。将混合物在-78℃下再搅拌45分钟,然后经过60分钟温热至室温。将混合物倒入400ml饱和氯化铵溶液中并用二氯甲烷重复萃取。合并有机相,用少量水洗涤,并用硫酸镁干燥。蒸发掉溶剂并将残余物通过使用流动相水/乙腈的制备型反相HPLC进行纯化。这得到7.27g (理论值的62%) 2-氯-N,1-二甲基-N-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-5-羧酰胺。

[0480] HPLC-MS: $\log P[n] = 0.88$; mass (m/z): 251.1; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}^6\text{-DMSO}$, 400MHz); $\delta = 3.37$ (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 6.20 (s, 1H), 7.45 (m, 1H), 7.86 (m, 1H), 8.49 (m, 1H), 8.53 (m, 1H) ppm。

[0481] 步骤3: N,1-二甲基-N-(吡啶-3-基)-2-[3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1H-咪唑-5-羧酰胺 (化合物I-1-007)

[0482]



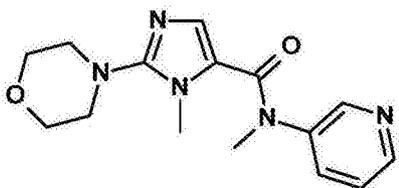
[0483] 首先将2-氯-N,1-二甲基-N-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-5-羧酰胺 (150mg, 0.59mmol) 加入二甲基甲酰胺 (5.0ml) 中,并加入碳酸铯 (389.9mg, 1.19mmol)。将反应混合物在120℃下搅拌过夜,然后在减压下完全蒸馏出溶剂。将残余物在硅胶上使用流动相乙酸乙酯/甲醇 (80:20) 进行色谱分离。这得到61mg (理论值的29.1%) N,1-二甲基-N-(吡啶-3-基)-2-[3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1H-咪唑-5-羧酰胺。

[0484] HPLC-MS: $\log P[n] = 1.87$; mass (m/z): 351.1; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}^6\text{-DMSO}$, 400MHz); $\delta = 3.42$ (s, 3H), 3.81 (s, 3H), 6.28 (s, 1H), 6.83 (m, 1H), 7.39 (m, 1H), 7.73 (m, 1H), 8.08 (m, 1H), 8.49 (m, 2H) ppm。

[0485] 合成实施例2

[0486] N,1-二甲基-2-(吗啉-4-基)-N-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-5-羧酰胺 (化合物I-1-009)

[0487]



[0488] 将2-氯-N,1-二甲基-N-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-5-羧酰胺 (150mg, 0.59mmol) 和吗啉 (216mg, 2.48mmol) 在100℃下搅拌过夜。将混合物倒入水中并用乙酸乙酯重复萃取。合并的有机相用硫酸镁干燥,减压蒸馏除去溶剂,残留物通过制备型反相HPLC使用流动相水/乙

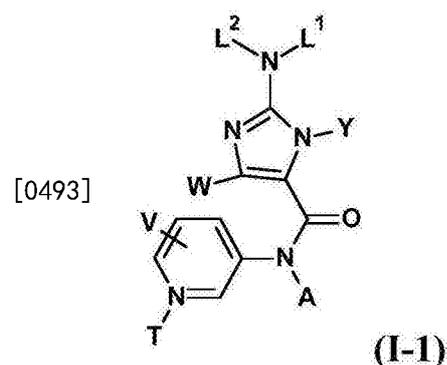
睛进行纯化。得到135mg (理论值的75.8%) N,1-二甲基-2-(吗啉-4-基)-N-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-5-羧酰胺。

[0489] HPLC-MS: $\log P[n] = 0.85$; mass (m/z) : 302.1; $^1\text{H-NMR}$ (CD_3CN , 400MHz) ; = 3.26 (m, 2H) , 3.30 (s, 3H) , 3.44 (m, 2H) , 3.57 (s, 3H) , 3.80 (m, 2H) , 3.93 (m, 2H) , 5.90 (s, 1H) , 7.6-8.0 (m, 2H) , 8.38-8.47 (m, 1H) , 8.59-8.67 (m, 1H) ppm。

[0490] 类似于上面给出的实施例所制备的其他式(I)的化合物列于表中1。

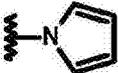
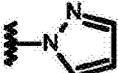
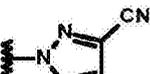
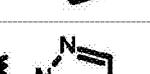
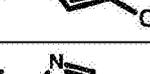
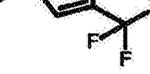
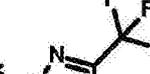
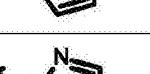
[0491] 表1

[0492] 式(I-1)的化合物

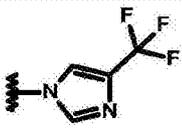
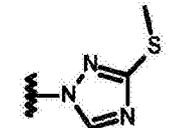
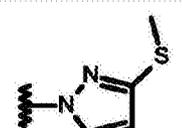
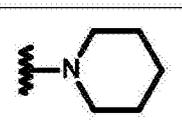
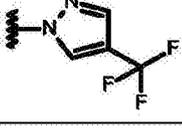
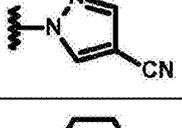
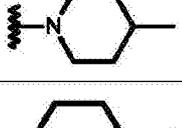
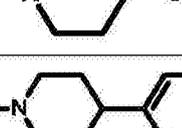
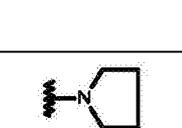
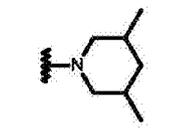
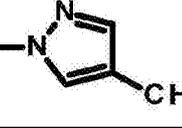
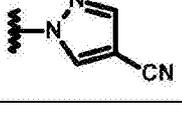
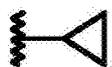


[0494] 其中,T代表自由电子对,其他取代基具有表中给出的含义:

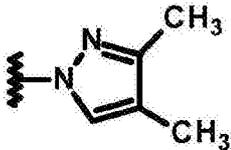
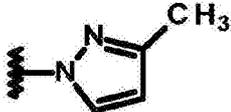
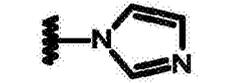
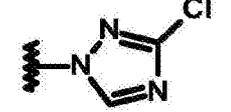
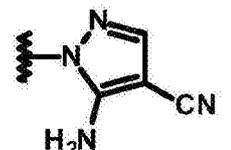
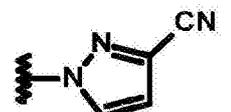
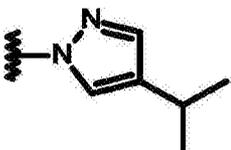
[0495]

实施例编号	L^1-N-L^2	Y	A	V	W	Logp [n] ^{a)}
I-1-001		CH ₃	CH ₃	H	H	1.27
I-1-002		CH ₃	CH ₃	H	H	1.01
I-1-003		CH ₃	CH ₃	H	H	1.31
I-1-004		CH ₃	CH ₃	H	H	1.48
I-1-005		CH ₃	CH ₃	H	H	1.49
I-1-006		CH ₃	CH ₃	H	H	1.82
I-1-007		CH ₃	CH ₃	H	H	1.87
I-1-008		CH ₃	CH ₃	H	H	1.14
I-1-009		CH ₃	CH ₃	H	H	0.85

[0496]

I-1-010		CH ₃	CH ₃	H	H	1.38
I-1-011		CH ₃	CH ₃	H	H	1.27
I-1-012		CH ₃	CH ₃	H	H	1.57
I-1-013		CH ₃	CH ₃	H	H	1.53
I-1-014		CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	2.09
I-1-015		CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	1.42
I-1-016		CH ₃	CH ₃	H	H	1.87
I-1-017		CH ₃	CH ₃	H	H	1.16
I-1-018		CH ₃	CH ₃	H	H	2.38
I-1-019		CH ₃	CH ₃	H	H	1.19
I-1-020		CH ₃	CH ₃	H	H	2.21
I-1-021		CH ₃	CH ₃	H	H	1.29
I-1-022		CH ₃		H	H	1.4

[0497]

I-1-023		CH ₃	CH ₃	H	H	1.42
I-1-024		CH ₃	CH ₃	H	H	1.18
I-1-025		CH ₃	CH ₃	H	H	0.56
I-1-026		CH ₃	CH ₃	H	H	1.17
I-1-027		CH ₃	CH ₃	H	H	1.5
I-1-028		CH ₃	CH ₃	H	H	0.78
I-1-029		CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	1.53
I-1-030		CH ₃	CH ₃	H	H	1.84
I-1-031		CH ₃	CH ₃	H	H	1.22

[0498] 表2:表1所选实施例的¹H NMR数据^{b)}

[0499]

实施例 I-1-001: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO):
 = 8.313(1.1);7.941(1.1);7.921(1.3);7.887(0.4);7.871(0.4);7.140(3.4);6.290(5.7);6.240(0.4);3.938(2.9);3.670(16.0);3.403(17.1);3.315(45.9);3.225(0.4);2.891(0.5);2.731(0.5);2.675(1.7);2.671(2.3);2.666(1.7);2.576(0.7);2.558(1.0);2.510(135.7);2.506(266.3);2.502(355.6);2.497(274.4);2.493(144.5);2.456(0.4);2.333(1.5);2.328(2.1);2.324(1.6);2.117(0.3);1.140(0.7);0.146(2.0);0.033(0.7);0.028(0.7);0.008(17.1);0.000(428.7);-0.008(18.8);-0.150(2.0)

实施例 I-1-002: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO):

[0500]

= 8.578(0.8);8.510(1.1);8.312(4.7);8.192(2.1);8.185(2.1);7.918(0.8);7.897(1.0);7.866(2.3);7.862(2.5);7.840(0.7);7.489(0.8);7.478(0.8);7.469(0.9);7.455(1.0);7.443(0.7);7.433(0.6);7.421(0.5);6.561(1.5);6.556(1.9);6.550(1.5);6.484(1.4);6.274(2.3);3.936(8.9);3.795(16.0);3.469(0.4);3.433(0.5);3.427(0.5);3.410(14.5);3.402(9.1);3.382(1.0);3.363(2.6);3.355(2.0);3.343(2.8);3.314(1369.0);3.278(1.0);3.270(0.5);3.253(0.4);3.243(0.4);2.895(0.6);2.885(0.3);2.784(0.4);2.772(0.3);2.740(0.3);2.675(7.9);2.670(11.0);2.666(8.4);2.637(0.8);2.621(0.7);2.593(1.0);2.523(27.6);2.519(41.7);2.510(558.5);2.506(1165.3);2.501(1606.2);2.496(1235.8);2.492(633.2);2.447(0.8);2.432(0.5);2.407(0.9);2.332(7.6);2.328(10.8);2.323(8.1);0.146(1.5);0.008(9.5);0.000(316.0);-0.008(12.1);-0.150(1.4)

实施例 I-1-003: ¹H-NMR(400.0 MHz, CD₃CN):

= 8.483(2.0);8.127(2.6);8.121(2.6);7.744(1.2);7.724(1.3);7.410(1.0);7.398(1.1);7.390(1.0);7.378(0.9);6.976(2.6);6.970(2.5);6.293(2.9);5.447(16.0);3.827(14.2);3.429(14.1);2.174(2.6);1.952(2.6);1.951(2.6);1.946(4.4);1.941(5.8);1.935(4.2);1.929(2.2);0.000(24.6)

实施例 I-1-004: ¹H-NMR(400.0 MHz, CD₃CN):

= 8.491(1.3);8.488(1.4);8.479(1.7);8.475(2.8);8.467(2.0);7.950(2.8);7.943(2.8);7.741(0.7);7.737(0.9);7.734(0.9);7.730(0.7);7.720(0.8);7.716(1.0);7.714(1.0);7.710(0.8);7.404(1.1);7.392(1.1);7.383(1.0);7.371(1.0);6.481(2.7);6.475(2.7);6.244(2.9);5.447(3.2);3.817(16.0);3.756(0.6);3.421(15.9);3.387(0.6);3.260(0.5);2.156(17.7);1.958(0.6);1.952(3.6);1.946(6.7);1.940(9.0);1.933(6.1);1.927(3.1);0.008(0.7);0.000(18.4);-0.009(0.7)

实施例 I-1-005: ¹H-NMR(400.0 MHz, CD₃CN):

= 8.492(1.1);8.488(1.2);8.480(1.2);8.476(1.5);8.472(1.8);8.466(1.7);8.051(3.8);7.756(3.2);7.744(0.7);7.740(0.8);7.737(0.8);7.734(0.7);7.723(0.8);7.720(0.9);7.717(0.9);7.713(0.8);7.406(1.0);7.394(1.0);7.386(0.9);7.374(0.8);6.249(2.7);5.446(12.0);3.814(16.0);3.420(15.6);2.155(6.6);1.964(0.3);1.958(0.8);1.952(4.7);1.946(8.7);1.939(11.9);1.933(8.3);1.927(4.3);0.008(0.8);0.000(23.7);-0.009(1.0)

实施例 I-1-006: ¹H-NMR(400.0 MHz, CD₃CN):

= 8.496(1.3);8.481(2.2);8.474(1.8);8.407(2.8);8.061(3.1);7.755(0.8);7.751(1.0);7.748(1.0);7.745(0.8);7.734(0.9);7.730(1.1);7.728(1.1);7.724(0.8);7.414(1.1);7.402(1.1);7.393(1.0);7.381(0.9);6.282(2.8);5.448(2.8);3.823(16.0);3.428(15.7);2.889(0.5);2.772(0.4);2.188(7.1);1.964(0.4);1.958(0.9);1.952(4.6);1.946(8.2);1.940(10.9);1.934(7.3);1.928(3.7);1.100(0.5);1.084(0.5);0.000(21.1);-0.008(0.7)

实施例 I-1-007: ¹H-NMR(400.0 MHz, CD₃CN):

= 8.498(1.6);8.495(1.7);8.483(3.7);8.477(2.5);8.098(2.0);8.094(2.0);7.751(0.9);7.747(1.1);7.745(1.1);7.741(0.9);7.731(1.0);7.727(1.2);7.724(1.2);7.721(1.0);7.411(1.2);7.410(1.1);7.399(1.3);7.391(1.2);7.379(1.1);6.842(2.3);6.836(2.3);6.284(3.0);3.817(16.0);3.429(15.9);2.145(5.5);1.963(0.4);1.952(4.4);1.945(7.9);1.939(10.3);1.933(7.2);1.927(3.7);0.008(2.2);0.000(23.1)

[0501]

<p>实施例 I-1-008: ¹H-NMR(400.0 MHz. CD₃CN): = 8.533(0.4);8.525(4.0);8.497(1.3);8.494(1.3);8.485(1.4);8.482(1.6);8.473(1.9);8.468(1.8);8.124(3.5);7.960(0.5);7.952(0.5);7.750(0.7);7.746(0.8);7.744(0.8);7.740(0.7);7.730(0.8);7.726(0.9);7.723(0.9);7.720(0.7);7.412(1.0);7.400(1.0);7.392(0.9);7.380(0.9);6.283(2.3);3.815(16.0);3.426(15.4);3.336(0.4);3.261(2.2);2.763(0.8);2.468(0.4);2.173(192.4);2.120(0.5);2.114(0.6);2.107(0.7);2.101(0.5);1.964(2.4);1.958(5.9);1.952(34.5);1.946(62.9);1.940(84.8);1.934(57.6);1.928(29.2);1.774(0.4);1.768(0.5);1.271(0.6);0.146(0.8);0.008(7.4);0.000(170.6);-0.009(6.3);-0.150(0.8)</p>
<p>实施例 I-1-009: ¹H-NMR(601.6 MHz. CD₃CN): = 19.985(0.6);9.485(0.7);8.922(1.3);8.845(1.0);8.676(1.1);8.609(0.8);8.463(0.9);8.405(0.7);8.000(1.8);7.952(0.8);7.894(0.8);7.621(0.8);6.998(1.2);6.714(1.0);3.925(6.5);3.815(5.5);3.798(5.1);3.678(6.6);3.646(2.6);3.595(2.7);3.531(9.1);3.454(5.1);3.382(2.3);3.307(5.2);3.303(8.2);3.168(6.7);2.926(4.9);2.859(9.1);2.692(16.0);1.976(9.8);1.972(10.9);1.968(9.3);1.087(0.5)</p>
<p>实施例 I-1-010: ¹H-NMR(400.0 MHz. CD₃CN): = 8.509(1.0);8.506(1.0);8.497(1.0);8.494(1.0);8.477(1.3);8.471(1.3);7.899(1.6);7.806(0.4);7.803(1.3);7.800(1.8);7.797(1.2);7.767(0.6);7.763(0.7);7.760(0.7);7.756(0.7);7.746(0.7);7.742(0.8);7.740(0.8);7.736(0.7);7.428(0.8);7.426(0.8);7.416(0.8);7.414(0.8);7.408(0.7);7.406(0.7);7.396(0.7);7.394(0.7);6.278(1.6);3.671(16.0);3.425(15.1);2.178(39.1);1.964(0.5);1.958(1.1);1.952(8.8);1.946(16.4);1.940(22.8);1.934(15.6);1.927(7.9);1.100(2.4);1.084(2.3);0.008(2.0);0.000(58.8);-0.009(1.9)</p>
<p>实施例 I-1-011: ¹H-NMR(400.0 MHz. CD₃CN): = 8.545(3.8);8.498(1.1);8.494(1.1);8.486(1.1);8.482(1.2);8.473(1.4);8.468(1.5);7.753(0.6);7.749(0.7);7.747(0.7);7.743(0.6);7.733(0.7);7.729(0.8);7.726(0.8);7.722(0.7);7.415(0.8);7.413(0.8);7.403(0.8);7.401(0.8);7.394(0.8);7.393(0.7);7.382(0.7);7.381(0.7);6.282(2.0);5.447(2.9);3.814(15.4);3.756(0.5);3.426(14.9);3.388(0.5);2.611(16.0);2.523(0.4);2.170(160.1);2.107(0.4);1.964(1.5);1.958(2.9);1.952(21.7);1.946(40.4);1.940(55.7);1.934(37.8);1.928(19.1);0.008(1.9);0.000(64.7);-0.009(2.1)</p>
<p>实施例 I-1-012: ¹H-NMR(400.0 MHz. CD₃CN): = 8.487(1.1);8.483(1.2);8.475(2.6);8.468(1.7);7.939(2.5);7.933(2.6);7.742(0.6);7.739(0.7);7.736(0.7);7.732(0.7);7.722(0.7);7.718(0.8);7.716(0.8);7.712(0.7);7.470(0.6);7.405(0.8);7.404(0.9);7.394(0.8);7.392(0.9);7.385(0.8);7.384(0.8);7.372(0.8);6.403(2.5);6.397(2.5);6.306(0.4);6.302(0.4);6.234(2.8);5.218(1.0);5.094(0.5);3.852(15.1);3.420(14.8);3.121(0.4);2.758(0.4);2.541(16.0);2.416(0.8);2.404(0.5);2.381(2.6);2.379(2.9);2.372(0.9);2.355(0.5);2.350(0.5);2.196(13.3);1.959(0.5);1.953(3.5);1.947(6.5);1.940(9.0);1.934(6.2);1.928(3.1);1.269(0.4);0.000(8.8)</p>
<p>实施例 I-1-013: ¹H-NMR(400.0 MHz. d₆-DMSO): = 8.497(2.7);8.490(2.7);8.477(1.6);8.474(1.9);8.465(1.7);8.462(1.9);7.837(0.9)</p>

[0502]

);7.833(1.1);7.831(1.2);7.827(1.0);7.816(1.0);7.813(1.2);7.810(1.3);7.806(1.0);7.457(1.4);7.445(1.4);7.436(1.3);7.424(1.2);5.915(5.4);5.756(2.3);3.522(16.0);3.338(15.8);3.321(27.8);2.923(3.1);2.911(4.3);2.897(3.5);2.506(15.6);2.501(22.0);2.497(17.4);1.617(0.7);1.589(3.2);1.578(2.6);1.512(1.5);1.501(1.4);0.781(0.3);0.008(0.4);0.000(9.6);-0.008(0.5)

实施例 I-1-014: ¹H-NMR(400.0 MHz. d₆-DMSO):

= 8.926(3.2);8.539(2.6);8.526(1.4);8.343(4.0);7.916(0.9);7.912(1.1);7.906(0.9);7.895(1.0);7.891(1.2);7.889(1.2);7.505(1.2);7.493(1.2);7.485(1.1);7.473(1.0);6.274(2.7);3.915(0.9);3.897(3.0);3.879(3.0);3.862(1.0);3.837(0.6);3.763(16.0);3.317(72.3);3.283(0.4);2.671(0.6);2.506(71.2);2.501(95.3);2.497(73.5);2.328(0.6);1.147(3.4);1.129(7.3);1.112(3.3);0.008(2.5);0.000(53.7)

实施例 I-1-015: ¹H-NMR(400.0 MHz. d₆-DMSO):

δ= 9.09(4.9);8.546(2.24);8.538(2.81);8.533(1.75);8.525(1.69);8.521(1.63);8.465(4.85);7.916(0.78);7.912(0.96);7.91(0.91);7.906(0.79);7.896(0.9);7.892(1.02);7.889(1.02);7.885(0.85);7.504(1.16);7.492(1.17);7.484(1.1);7.472(1.06);6.281(2.27);4.346(1.23);4.335(1.28);3.914(0.81);3.896(2.67);3.878(2.71);3.861(0.85);3.794(0.37);3.784(0.4);3.779(0.59);3.765(16);3.754(0.56);3.324(4.47);2.512(5.8);2.508(12.14);2.503(16.16);2.499(11.5);2.494(5.45);1.144(3.13);1.127(7.09);1.109(3.04);1.046(9.45);1.031(9.35);0(9.17);-0.008(0.33)

实施例 I-1-016: ¹H-NMR(400.0 MHz. d₆-DMSO):

= 8.495(2.2);8.489(2.3);8.476(1.5);8.472(1.7);8.464(1.6);8.461(1.7);7.834(0.8);7.831(1.0);7.828(1.0);7.824(0.9);7.814(0.9);7.810(1.1);7.808(1.1);7.804(0.9);7.456(1.2);7.444(1.2);7.435(1.1);7.423(1.1);5.912(5.3);5.753(0.5);3.518(16.0);3.337(15.6);3.317(32.1);3.192(1.3);3.161(1.5);2.712(0.9);2.707(1.0);2.682(1.8);2.676(1.9);2.652(0.9);2.646(0.8);2.524(0.8);2.510(17.1);2.506(36.3);2.501(51.1);2.497(39.3);2.493(19.8);1.646(1.1);1.619(1.2);1.614(1.2);1.490(0.3);1.480(0.4);1.472(0.4);1.463(0.5);1.454(0.4);1.291(0.5);1.282(0.5);1.260(1.0);1.251(1.1);1.230(0.9);1.222(0.9);1.201(0.3);0.933(5.9);0.916(5.6);0.008(1.0);0.000(30.1);-0.008(1.3)

实施例 I-1-018: ¹H-NMR(400.0 MHz. d₆-DMSO):

= 8.512(2.4);8.506(2.4);8.485(1.7);8.482(1.8);8.473(1.8);8.470(1.8);8.314(0.4);8.025(2.5);7.850(0.9);7.846(1.1);7.843(1.0);7.839(0.9);7.829(1.1);7.825(1.1);7.823(1.2);7.819(1.0);7.466(1.3);7.455(1.3);7.446(1.2);7.434(1.1);7.326(1.0);7.318(1.0);7.307(3.1);7.300(2.5);7.290(3.8);7.279(4.2);7.274(4.8);7.253(2.8);7.249(3.0);7.232(1.4);7.223(0.7);7.216(1.2);7.212(1.8);7.208(1.1);7.195(2.8);7.189(0.7);7.178(1.1);5.947(5.7);4.330(0.4);4.325(0.4);4.319(0.4);4.298(0.4);4.293(0.4);4.288(0.4);3.800(0.4);3.794(0.4);3.789(0.4);3.767(0.4);3.762(0.5);3.756(0.4);3.575(16.0);3.350(16.6);3.317(113.0);3.173(0.5);3.165(0.4);3.141(0.8);3.134(0.8);3.108(0.4);3.101(0.4);2.881(0.7);2.850(1.0);2.844(1.1);2.828(0.9);2.814(0.7);2.805(0.5);2.796(0.7);2.788(0.4);2.766(0.4);2.710(0.4);2.702(0.6);2.675(1.7);2.670(2.3);2.666(1.4);2.661(1.1);2.645(1.0);2.638(1.0);2.622(0.3);2.524(3.1);2.519(5.0);2.510(67.0);2.506(141.1);2.501(197.5);2.497(147.5)

[0503]

);2.492(70.8);2.332(0.8);2.328(1.1);2.323(0.8);1.841(0.5);1.834(0.5);1.817(2.0);1.810(2.5);1.798(3.3);1.790(2.7);1.771(1.1);1.762(1.0);1.550(0.7);1.539(0.6);1.519(0.6);1.507(0.5);1.477(0.3);1.445(0.6);1.434(0.6);1.414(0.5);1.403(0.5);0.146(0.5);0.008(3.7);0.000(109.9);-0.009(3.8);-0.150(0.5)

实施例 I-1-019: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO):

= 8.486(2.0);8.480(2.0);8.460(1.5);8.456(1.6);8.448(1.6);8.444(1.6);8.313(0.5);7.821(0.8);7.817(0.9);7.814(0.9);7.811(0.8);7.800(0.9);7.797(1.0);7.794(1.0);7.790(0.9);7.448(1.1);7.436(1.1);7.428(1.0);7.416(1.0);5.895(5.8);3.547(16.0);3.332(15.8);3.316(32.2);3.303(2.6);3.292(2.0);3.286(5.8);3.269(2.1);2.675(0.6);2.670(0.6);2.666(0.4);2.524(1.5);2.519(2.2);2.510(31.6);2.506(67.0);2.501(94.5);2.496(70.6);2.492(33.9);2.332(0.4);2.328(0.6);2.323(0.4);1.832(2.1);1.823(2.1);1.815(5.7);1.807(2.1);1.798(2.0);1.561(0.4);0.008(1.5);0.000(47.5);-0.009(1.6)

实施例 I-1-020: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO):

= 8.497(0.6);8.490(2.8);8.484(2.4);8.474(2.0);8.471(1.9);8.463(2.0);8.459(1.8);8.313(0.4);7.832(1.0);7.828(1.2);7.826(1.0);7.822(0.9);7.812(1.2);7.808(1.2);7.805(1.1);7.802(0.9);7.456(1.3);7.444(1.4);7.435(1.3);7.424(1.2);5.913(5.5);5.906(1.2);3.549(2.9);3.518(16.0);3.339(19.0);3.317(77.1);3.155(1.2);3.128(1.3);2.675(0.6);2.670(0.8);2.666(0.6);2.610(0.3);2.524(2.1);2.510(40.6);2.506(83.5);2.501(115.5);2.497(86.2);2.492(41.4);2.332(0.5);2.328(0.7);2.324(0.5);2.247(1.3);2.219(2.3);2.189(1.5);1.756(1.0);1.749(1.1);1.726(1.5);1.718(1.2);1.700(0.6);1.363(0.3);1.349(0.5);0.980(2.0);0.963(2.0);0.870(0.4);0.853(0.5);0.836(10.4);0.820(10.3);0.764(1.6);0.747(1.5);0.654(0.8);0.624(0.7);0.008(2.1);0.000(60.4);-0.009(2.2)

实施例 I-1-021: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ = 8.572(2.06);8.566(2.11);8.505(1.45);8.502(1.53);8.493(1.55);8.49(1.49);7.94(3.22);7.913(0.84);7.91(1.02);7.903(0.82);7.893(0.94);7.889(1.08);7.887(1.06);7.883(0.88);7.679(3.82);7.625(0.66);7.485(1.15);7.473(1.16);7.464(1.1);7.453(1.04);7.188(0.57);7.185(0.58);6.847(0.61);6.844(0.6);6.247(3.04);5.756(10.05);3.798(16);3.662(3.33);3.403(14.59);3.321(41.24);2.67(0.74);2.506(97.87);2.501(127.31);2.497(94.18);2.333(0.55);2.328(0.73);2.324(0.55);2.094(2.3);2.074(10.47);0.146(0.61);0.008(5.91);0(135.75);-0.008(6.47);-0.15(0.6)

实施例 I-1-022: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ = 9.138(5.04);8.576(2.35);8.57(2.38);8.514(1.66);8.511(1.72);8.502(1.82);8.499(1.81);8.48(4.97);8.141(0.63);7.873(0.94);7.869(1.19);7.867(1.16);7.863(0.93);7.853(1.07);7.849(1.28);7.847(1.29);7.843(0.99);7.496(1.29);7.484(1.28);7.476(1.26);7.464(1.19);6.938(2.34);5.755(15.9);3.744(16);3.732(1.3);3.424(0.64);3.416(0.85);3.407(1.23);3.398(0.88);3.389(0.67);3.379(0.42);3.321(1.59);2.506(20.92);2.502(27.82);2.498(21.37);2.074(2.06);0.89(0.53);0.872(2.32);0.858(2.38);0.854(2.06);0.841(0.68);0.608(0.7);0.595(2.09);0.589(2.34);0.586(2.16);0.581(2.03);0.568(0.59);0.008(0.84);0(19.56);-0.008(0.97)

实施例 I-1-023: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO):

[0504]

δ = 8.562(2.48);8.556(2.53);8.5(1.69);8.497(1.88);8.488(1.75);8.485(1.82);7.897(1.18);7.893(1.01);7.882(1.01);7.876(1.29);7.873(1.05);7.834(3.4);7.479(1.35);7.467(1.36);7.458(1.31);7.446(1.19);6.212(3.64);4.098(0.51);4.085(0.53);3.817(16);3.579(0.33);3.411(0.62);3.396(14.94);3.375(0.43);3.321(24.41);3.175(2.52);3.162(2.48);2.671(0.34);2.506(39.91);2.501(52.02);2.497(40.53);2.328(0.33);2.18(14.65);2.09(0.49);1.99(12);1.914(0.58);0(21.58)

实施例 I-1-024: ¹H-NMR(400.0 MHz. d₆-DMSO):

δ = 8.57(1.63);8.564(1.67);8.53(0.44);8.524(0.47);8.504(1.18);8.5(1.36);8.492(1.3);8.489(1.32);8.047(1.87);8.041(1.94);7.911(0.64);7.908(0.79);7.905(0.79);7.901(0.72);7.891(0.73);7.887(0.82);7.885(0.87);7.881(0.73);7.483(0.89);7.47(0.98);7.463(0.91);7.45(0.88);6.348(1.95);6.342(2);6.235(2.41);6.208(0.54);5.756(16);3.811(12.36);3.755(0.58);3.749(3.73);3.415(0.65);3.402(11.54);3.375(3.56);3.32(25.51);2.67(0.4);2.51(25.65);2.506(51.18);2.501(67.9);2.497(51.03);2.328(0.39);2.269(10.65);0.008(1.84);0(44.91);-0.008(2.59)

实施例 I-1-025: ¹H-NMR(400.0 MHz. d₆-DMSO):

δ = 8.576(1.94);8.57(1.98);8.523(1.38);8.52(1.48);8.512(1.45);8.508(1.44);8.062(2.36);7.928(0.83);7.924(0.99);7.922(1);7.918(0.89);7.908(0.95);7.904(1.07);7.901(1.12);7.898(0.93);7.609(2.44);7.5(1.17);7.488(1.18);7.48(1.11);7.468(1.05);7.136(2.23);6.276(2.27);5.756(3.47);3.666(16);3.409(14.91);3.33(47.46);2.511(11.43);2.506(22.93);2.502(30.49);2.497(22.91);2.493(11.75);0.008(0.56);0(14.89);-0.008(0.68)

实施例 I-1-026: ¹H-NMR(400.0 MHz. d₆-DMSO):

δ = 9.182(0.34);9.159(6.04);9.134(0.38);8.585(2.05);8.579(2.06);8.515(1.46);8.512(1.66);8.504(1.59);8.5(1.63);7.933(0.8);7.929(0.95);7.926(0.96);7.922(0.87);7.912(0.93);7.908(1.03);7.906(1.06);7.902(0.91);7.49(1.16);7.478(1.16);7.47(1.09);7.458(1.02);6.37(1.46);3.818(2.05);3.755(16);3.639(1.15);3.426(0.67);3.415(14.38);3.319(35.08);3.174(0.6);3.162(0.58);2.675(0.62);2.67(0.84);2.666(0.64);2.524(2.77);2.51(52.45);2.506(107.24);2.501(143.05);2.497(105.63);2.492(52.77);2.333(0.62);2.328(0.86);2.324(0.63);0.008(1.65);0(46.68);-0.008(1.76)

实施例 I-1-027: ¹H-NMR(400.0 MHz. d₆-DMSO):

δ = 8.568(3.96);8.562(4.1);8.503(2.85);8.491(2.91);7.909(1.44);7.904(1.84);7.899(1.56);7.888(1.65);7.883(2.05);7.879(1.67);7.733(2.65);7.522(4.63);7.484(2.11);7.472(2.16);7.464(2.09);7.452(1.91);6.264(3.13);6.219(2.65);3.855(16);3.814(12.54);3.401(21.22);3.324(62.51);3.175(0.92);3.162(0.91);2.763(1.32);2.746(2.44);2.727(1.71);2.708(1.64);2.69(2.81);2.671(2.42);2.646(1.37);2.628(2.5);2.61(2.47);2.592(2.23);2.574(1.9);2.506(53.39);2.502(69.77);2.498(51.89);2.468(1.27);2.45(0.43);2.405(0.62);2.387(1.62);2.369(2);2.351(1.24);2.333(0.65);0(57.19)

实施例 I-1-028: ¹H-NMR(400.0 MHz. d₆-DMSO):

δ = 8.627(5.21);8.56(3.59);8.554(2.67);8.528(0.44);8.523(0.41);8.5(2.4);8.497(2.48);8.488(2.28);7.898(1.68);7.881(1.61);7.878(1.69);7.477(1.6);7.464(1.9);

[0505]

7.456(1.51);7.445(1.28);6.242(3.41);6.208(0.32);6.084(5.36);5.756(0.58);3.807(16);3.748(1.56);3.694(0.38);3.446(0.51);3.394(15.21);3.375(2.46);3.328(29.27);3.321(64.19);2.67(0.66);2.505(105.11);2.501(111.87);2.328(0.64);1.237(0.38);0.146(0.32);0.006(27.04);0(66.97);-0.15(0.36)

实施例 I-1-029: ¹H-NMR(400.0 MHz. d₆-DMSO):

δ = 8.556(0.32);8.544(2.61);8.537(2.76);8.53(2.16);8.522(4.8);8.516(3.81);7.913(0.88);7.909(1.09);7.907(1.09);7.904(0.95);7.893(1.03);7.887(1.19);7.883(0.95);7.5(1.33);7.488(1.33);7.48(1.24);7.468(1.12);7.29(3.16);7.284(3.14);6.296(2.49);3.917(1);3.899(3.01);3.881(3.02);3.863(1);3.809(0.36);3.778(16);3.754(1.13);3.732(0.37);3.704(0.66);3.32(42.95);3.174(0.68);3.162(0.68);2.67(0.62);2.666(0.47);2.506(81.79);2.502(106.33);2.497(79.85);2.328(0.62);1.146(3.44);1.128(7.54);1.11(3.52);0.008(0.9);0(19.74)

实施例 I-1-030: ¹H-NMR(400.0 MHz. d₆-DMSO):

δ = 8.574(2.04);8.568(2.06);8.504(1.4);8.501(1.5);8.492(1.47);8.489(1.46);8.043(2.66);8.036(2.66);7.916(0.77);7.912(0.95);7.91(0.92);7.906(0.8);7.896(0.88);7.892(1);7.89(0.99);7.886(0.8);7.485(1.09);7.473(1.08);7.464(1.02);7.453(0.95);6.414(2.69);6.408(2.67);6.234(2.96);3.815(14.68);3.404(13.75);3.32(97.79);3.008(0.37);2.991(0.94);2.974(1.27);2.956(0.99);2.939(0.4);2.675(0.66);2.67(0.89);2.666(0.68);2.506(121.42);2.501(158.45);2.497(116.77);2.332(0.7);2.328(0.93);2.324(0.69);1.252(16);1.234(15.75);0.008(0.78);0(21.82);-0.008(0.96)

实施例 I-1-031: ¹H-NMR(601.6 MHz. d₆-DMSO):

δ = 9.506(0.41);9.465(5.89);8.589(2.13);8.586(2.18);8.514(1.63);8.512(1.69);8.506(1.68);8.504(1.62);7.931(0.92);7.929(1.12);7.927(1.09);7.925(0.97);7.918(1.02);7.915(1.15);7.914(1.15);7.911(0.96);7.486(1.22);7.485(1.2);7.478(1.21);7.472(1.22);7.471(1.18);7.464(1.12);6.43(0.8);3.85(1.32);3.818(0.49);3.781(16);3.433(0.6);3.424(14.14);3.314(1.82);2.508(4.44);2.505(8.94);2.502(12.04);2.499(9.08);2.496(4.57)

[0506] a) 上表和以上制备实施例中记录的logP值根据EEC指令79/831Annex V.A8,通过HPLC(高效液相色谱)使用反相柱(C18)测定。温度为43℃。校准用未支化的烷-2-酮(具有3至16个碳原子)进行,其logP值是已知的。

[0507] 通过LC-MS在酸性范围内测定M⁺在pH 2.7下进行,使用流动相0.1%甲酸和乙腈水溶液(含0.1%甲酸);线性梯度从10%乙腈到95%乙腈,仪器:Agilent 1100LC系统,Agilent MSD系统,HTS PAL。

[0508] 通过LC-MS在中性范围内测定M⁺是在pH 7.8下进行,使用流动相0.001摩尔碳酸氢铵水溶液和乙腈;线性梯度从10%乙腈到95%乙腈。

[0509] 酸性范围的logP值(作为logP[a])和/或中性范围的logP值(作为logP[n])在上表和以上制备实施例中列出。

[0510] b) ¹H NMR数据的测定使用以四甲基硅烷作为参照物(0.0)以及溶剂CD₃CN、CDCl₃或D₆-DMSO的装有样品流动头(容量60μL)的Bruker Avance 400进行。

[0511] 所选实施例的NMR数据以常规形式(δ 值,多重峰分裂,氢原子数)或以NMR峰列表列

出。

[0512] NMR峰列表方法

[0513] 所选实施例的¹H NMR数据以¹H NMR峰列表的形式给出。对于每个信号峰,先列出以ppm为单位的 δ 值,后在圆括号内列出信号强度。对于不同信号峰, δ 值-信号强度数对通过分号彼此间隔列出。

[0514] 因此,一个实施例的峰值列表具有以下形式:

[0515] δ_1 (强度₁); δ_2 (强度₂);.....; δ_i (强度_i);.....; δ_n (强度_n)

[0516] 在以cm为单位的NMR谱的打印实例中,尖锐信号的强度与的信号高度相关,并显示出信号强度的真实比例。在宽峰信号的情况下,相比于光谱中的最强信号,可以显示信号的数个峰或中间峰及它们的相对强度。

[0517] 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完成,特别是在DMSO中测量的谱图的情况下。因此,在NMR峰列表中可以不出现四甲基硅烷峰。

[0518] ¹H NMR峰的列表与常规¹H NMR打印输出类似,因此通常包含在常规NMR解析中列出的所有峰。

[0519] 另外,如同常规¹H NMR打印输出,其可显示出溶剂信号、同样由本发明提供的目标化合物的立体异构体的信号和/或杂质的峰。

[0520] 在记录溶剂和/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溶剂峰,例如在DMSO-D₆中的DMSO的峰和水的峰,其通常具有平均较高的强度。

[0521] 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(例如具有>90%的纯度)的峰平均更低的强度。

[0522] 这样的立体异构体和/或杂质可以是特定的制备方法所特有的。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。

[0523] 如需要,从业人员通过已知方法(MestreC,ACD模拟,以及凭经验评估的预期值)计算目标化合物的峰,视需要任选地使用其他强度过滤器来分离目标化合物的峰。这种分离与常规¹H NMR解析中拾取相关峰相似。

[0524] ¹H NMR峰列表的其他细节可参见研究公开数据库编号564025(Research Disclosure Database Number 564025)。

[0525] 用途实施例

[0526] 以下实施例显示了本发明化合物的杀虫和杀螨作用。在这些实施例中,所引用的本发明的化合物涉及表1中列出的具有相应的参考标号(编号)的化合物:

[0527] 微小牛蜱(Boophilus microplus)-注射测试

[0528] 溶剂:二甲基亚砜

[0529] 为制备合适的活性化合物制剂,将10mg的活性化合物与0.5ml溶剂混合,并用溶剂将浓缩物稀释到所需浓度。

[0530] 将1 μ l的活性化合物溶液注射到5只饱食的成年雌牛蜱(微小牛蜱)的腹中。将这些动物转移到培养皿中,并放在气候控制室中。

[0531] 7天后,通过能育卵的产卵数来评估功效。将未见能育的卵储存在气候控制箱中,直到约42天后孵化出幼虫。100%的功效意指没有蜱产生任何能育卵;0%的功效意指所有

卵都是能育的。

[0532] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在20 μ g/动物的施用率下显示出80%的功效:I-1-031

[0533] 桃蚜(Myzus persicae)-口服测试(oral test)

[0534] 溶剂:100重量份的丙酮

[0535] 为制备合适的活性化合物制剂,使用指定重量份的溶剂溶解1重量份的活性化合物,并用水补足直至达到所需浓度。

[0536] 将50 μ l活性化合物制剂转移至微量滴定板中并用150 μ l IPL41昆虫培养基(33%+15%糖)补足至200 μ l的最终体积。随后,将板用封口膜密封,在第二微量滴定板内有绿桃蚜(green peach aphid(桃蚜(Myzus persicae)))混合种群,它们能够刺穿所述封口膜并通过其吸收溶液。

[0537] 5天后,测定以%计的功效。100%意指所有桃蚜都已被杀死;0%意指没有桃蚜被杀死。

[0538] 在本测试中,例如,以下制备实施例的化合物在20ppm的施用率下显示出100%的功效:I-1-001、I-1-002、I-1-003、I-1-004、I-1-005、I-1-006、I-1-007、I-1-008、I-1-009、I-1-010、I-1-011、I-1-012、I-1-013、I-1-014、I-1-015、I-1-016、I-1-017、I-1-018、I-1-019、I-1-020、I-1-021、I-1-022。

[0539] 桃蚜-喷洒测试

[0540] 溶剂:78重量份的丙酮

[0541] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0542] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0543] 为制备合适的活性成分制剂,将1重量份的活性成分用所述重量份的溶剂溶解,并用含有1000ppm的乳化剂浓度的水补充直到达到所需浓度。为了制备其他测试浓度,将制剂用含有乳化剂的水进行稀释。

[0544] 在被所有阶段的绿桃蚜(green peach aphid(桃蚜(Myzus persicae)))侵染的大白菜(白菜)叶片的叶面上喷洒所需浓度的活性化合物制剂。

[0545] 5-6天后,测定以%计的功效。100%意指所有桃蚜都已被杀死;0%意指没有桃蚜被杀死。

[0546] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在500g/ha的施用率下显示出100%的功效:I-1-004、I-1-006、I-1-007、I-1-008、I-1-009、I-1-010、I-1-011、I-1-013、I-1-017、I-1-018、I-1-019、I-1-020、I-1-021。

[0547] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在500g/ha的施用率下显示出90%的功效:I-1-001、I-1-002、I-1-003、I-1-005、I-1-012、I-1-014、I-1-015、I-1-016、I-1-022。

[0548] 二斑叶螨(Tetranychus urticae)-喷洒测试,OP-抗性

[0549] 溶剂:78.0重量份的丙酮

[0550] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0551] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0552] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物用所述重量份的溶剂溶解,并用含有1000ppm的乳化剂浓度的水补充直至达到所需浓度。为了制备其他测试浓度,

将该制剂用含有乳化剂的水进行稀释。

[0553] 在被各阶段的温室红蛛螨(二斑叶螨(*Tetranychus urticae*))侵染的菜豆(*Phaseolus vulgaris*)叶的叶面上喷洒所需浓度的活性化合物制剂。

[0554] 6天后,测定以%计的功效。100%意指所有红蛛螨都已被杀死;0%意指没有红蛛螨被杀死。

[0555] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在500g/ha的施用率下显示出90%的功效:I-1-009、I-1-015。

[0556] 例证实施例

[0557] 桃蚜-喷洒测试(MYZUPE)

[0558] 溶剂:78重量份的丙酮

[0559] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0560] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0561] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物用所述重量份的溶剂来溶解,并用含有1000ppm的乳化剂浓度的水补充直到达到所需浓度。为了制备其他测试浓度,将该制剂用含有乳化剂的水进行稀释。

[0562] 在被所有阶段的绿桃蚜(*green peach aphid*(桃蚜(*Myzus persicae*)))侵染的大白菜(白菜)叶片的叶面上喷洒所需浓度的活性化合物制剂。

[0563] 在所需时间周期(天(dat))后,测定以%计的功效。100%意指所有桃蚜都已被杀死;0%意指没有桃蚜被杀死。

[0564] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物相对于现有技术显示出优异的功效:参见表3。

[0565] 桃蚜-口服测试(MYZUPE O)

[0566] 溶剂:100重量份的丙酮

[0567] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物用所述重量份的溶剂溶解,并用水补足直至达到所需浓度。

[0568] 将50 μ l活性化合物制剂转移至微量滴定板中并用150 μ l IPL41昆虫培养基(33%+15%糖)补足至200 μ l的最终体积。随后,,将板用封口膜密封,在第二微量滴定板内有绿桃蚜(*green peach aphid*(桃蚜(*Myzus persicae*)))混合种群,它们能够刺穿所述封口膜并通过其而吸收溶液。

[0569] 在所需时间周期(天)后,测定以%计的功效。100%意指所有桃蚜都已被杀死;0%意指没有桃蚜被杀死。

[0570] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物相对于现有技术表现出优异的功效:参见表3。

[0571] 二斑叶螨-喷洒测试;OP-抗性(TETRUR)

[0572] 溶剂:78.0重量份的丙酮

[0573] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[0574] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[0575] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物用所述重量份的溶剂溶解并用含有1000ppm的乳化剂浓度的水补充直至达到所需浓度。为了制备其他测试浓度,将

制剂用含有乳化剂的水进行稀释。

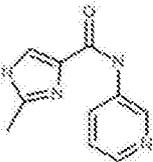
[0576] 在被各阶段的温室红蜘蛛(二斑叶螨(*Tetranychus urticae*)) 侵染的菜豆(*Phaseolus vulgaris*) 叶的叶面上喷洒具有所需浓度的活性化合物制剂。

[0577] 在所需时间周期(天)后,测定以%计的功效。100%意指所有温室红蜘蛛都已被杀死;0%表示没有温室红蜘蛛被杀死。

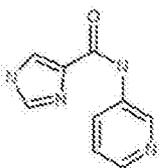
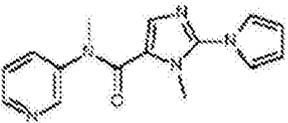
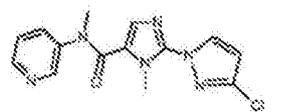
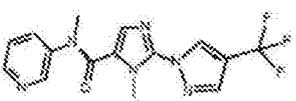
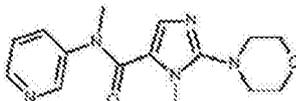
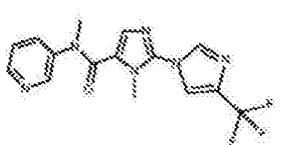
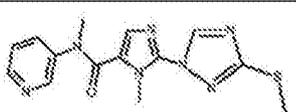
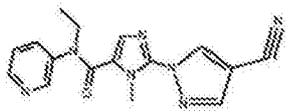
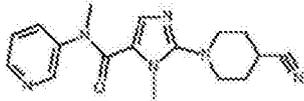
[0578] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物相对于现有技术表现出优异的功效:参见表3。

[0579] 表3:

[0580]

物质	结构	动物物种	浓度	%功效	天
现有技术 WO2011/009804 的 实施例 14		MYZUPE	100 g ai/ha	0	5/6 天
		MYZUPE O	4 ppm	0	5 天
			0.8 ppm	0	5 天
		TETRUR	500 g/ha	0	6 天

[0581]

现有技术 WO2011/009804 的 实施例 13		MYZUPE MYZUPE O TETRUR	100 g ai/ha 4 ppm 0.8 ppm 500 g/ha	0 0 0 0	6 天 5 天 5 天 6 天
本发明的实施例 I- 1-001		MYZUPE MYZUPE O	100 g ai/ha 4 ppm 0.8 ppm	90 100 100	6 天 5 天 5 天
本发明的实施例 I- 1-004		MYZUPE MYZUPE O	100 g ai/ha 4 ppm 0.8 ppm	90 100 100	6 天 5 天 5 天
本发明的实施例 I- 1-006		MYZUPE MYZUPE O	100 g ai/ha 0.8 ppm	100 100	6 天 5 天
本发明的实施例 I- 1-009		MYZUPE MYZUPE O TETRUR	100 g ai/ha 0.8 ppm 500 g/ha	70 70 90	6 天 5 天 6 天
本发明的实施例 I- 1-010		MYZUPE MYZUPE O	100 g ai/ha 4 ppm 0.8 ppm	70 100 100	6 天 5 天 5 天
本发明的实施例 I- 1-011		MYZUPE MYZUPE O	100 g ai/ha 4 ppm 0.8 ppm	70 90 90	5 天 5 天 5 天
本发明的实施例 I- 1-015		MYZUPE O TETRUR	4 ppm 0.8 ppm 500 g/ha	100 100 90	5 天 5 天 6 天
本发明的实施例 I- 1-017		MYZUPE MYZUPE O	100 g ai/ha 4 ppm 0.8 ppm	90 100 100	5 天 5 天 5 天