

(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 102834391 A

(43) 申请公布日 2012. 12. 19

(21) 申请号 201180015357. 1

代理人 刘金辉 林柏楠

(22) 申请日 2011. 03. 21

(51) Int. Cl.

(30) 优先权数据

C07D 403/12 (2006. 01)

61/316482 2010. 03. 23 US

C07D 405/12 (2006. 01)

C07D 409/12 (2006. 01)

(85) PCT申请进入国家阶段日

A01N 43/58 (2006. 01)

2012. 09. 24

A01N 43/80 (2006. 01)

(86) PCT申请的申请数据

PCT/IB2011/051176 2011. 03. 21

(87) PCT申请的公布数据

W02011/117804 EN 2011. 09. 29

(71) 申请人 巴斯夫欧洲公司

地址 德国路德维希港

(72) 发明人 R·勒韦佐 S·索格尔

C·德菲博尔 S·格罗斯

K·科尔博尔 D·D·安斯帕夫

D·L·卡伯特森

(74) 专利代理机构 北京市中咨律师事务所

11247

权利要求书 4 页 说明书 74 页

(54) 发明名称

防治无脊椎动物害虫的哒嗪化合物

(57) 摘要

公开了式 (I) 或 (II) 的哒嗪化合物及其盐和 N-氧化物, 其中各取代基具有说明书中所定义的含义。还公开了一种防治无脊椎动物害虫的方法, 一种保护植物繁殖材料和 / 或由其生长的植物的方法, 包含至少一种所述哒嗪化合物的植物繁殖材料, 一种处理或保护动物以防寄生虫侵袭或侵染的方法以及一种含有至少一种所述哒嗪化合物的农业组合物。

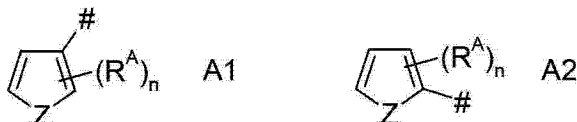


1. 式 I 或 II 的哒嗪化合物或其可农用或可兽用盐、N-氧化物、对映体或非对映体：



其中

A 为式 A1 或 A2 的咪喃、噁吩或吡咯基团：



其中 # 表示与式 I 或 II 的剩余部分的键合位置，并且其中

n 为 0、1、2 或 3；

R^A 独立于整数 n 选自氢、卤素、CN、NO₂、C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 链烯基和 C₂-C₁₀ 炔基，其中后提到的 3 个基团可以未被取代，可以部分或完全被卤代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^x ，或者其中各 R^A 进一步相互独立地选自 OR^a、C(Y)R^b、C(Y)OR^c、S(O)_mR^d、NR^eR^f、杂环基、C₃-C₁₀ 环烷基和 C₅-C₁₀ 环烯基，其中后提到的 3 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^x ，其中

Z 为 O、S 或 NR^N；

V 为 C(R^v) 或 N；

W 为 C(R^w) 或 N；

条件是 V 或 W 为 N；

R^N 选自氢、CN、NO₂、C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 链烯基和 C₂-C₁₀ 炔基，其中后提到的 3 个基团可以未被取代、可以部分或完全被卤代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^x ，或者其中 R^N 进一步选自 OR^a、C(Y)R^b、C(Y)OR^c、S(O)_mR^d、NR^eR^f、C(Y)NR^gR^h、S(O)_mNR^eR^f、C(Y)NRⁱNR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -OR^a、C₁-C₅ 亚烷基 -CN、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)R^b、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)OR^c、C₁-C₅ 亚烷基 -NR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)NR^gR^h、C₁-C₅ 亚烷基 -S(O)_mR^d、C₁-C₅ 亚烷基 -S(O)_mNR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -NRⁱNR^eR^f、杂环基、杂芳基、C₃-C₁₀ 环烷基、C₅-C₁₀ 环烯基、杂环基 -C₁-C₅ 烷基、杂芳基 -C₁-C₅ 烷基、C₃-C₁₀ 环烷基 -C₁-C₅ 烷基、C₅-C₁₀ 环烯基 -C₁-C₅ 烷基、苯基 -C₁-C₅ 烷基和苯基，其中后提到的 10 个基团的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^y ，

R^t 、 R^u 、 R^v 和 R^w 相互独立地选自氢、卤素、C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₃ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₃ 卤代烷硫基、C₁-C₄ 烷基亚磺酰基、C₁-C₃ 卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄ 烷基磺酰基、C₁-C₃ 卤代烷基磺酰基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 炔基或 C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基；

X^1 为 S、O 或 NR^{1a}，其中 R^{1a} 选自氢、C₁-C₁₀ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₁₀ 环烷基、C₃-C₁₀ 环烷基甲基、C₃-C₁₀ 卤代环烷基、C₂-C₁₀ 链烯基、C₂-C₁₀ 卤代链烯基、C₂-C₁₀ 炔基、C₁-C₁₀ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、OR^a、苯基、杂芳基、杂环基、苯基 -C₁-C₄ 烷基、杂芳基 -C₁-C₄ 烷基、杂环基 -C₁-C₄ 烷基，其中后提到的 6 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的取代基；

X^2 为 OR^{2a} 、 $NR^{2b}R^{2c}$ 、 $S(O)_mR^{2d}$, 其中

R^{2a} 选自 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 卤代链烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基- C_1-C_4 烷基、杂芳基- C_1-C_4 烷基和杂环基- C_1-C_4 烷基, 其中后提到的 6 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的取代基, 并且其中

R^{2b} 、 R^{2c} 相互独立地选自氢、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 卤代链烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷基羰基、 C_1-C_4 卤代烷基羰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基、苯基、苯基羰基、苯基磺酰基、杂芳基、杂芳基羰基、杂芳基磺酰基、杂环基、杂环基羰基、杂环基磺酰基、苯基- C_1-C_4 烷基、杂芳基- C_1-C_4 烷基和杂环基- C_1-C_4 烷基, 其中后提到的 12 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的取代基; 或者

R^{2b} 和 R^{2c} 与它们所键合的氮原子一起形成 5 或 6 员饱和或不饱和杂环, 所述杂环可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员原子并且其中所述杂环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的取代基, 以及其中

R^{2d} 选自 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 卤代链烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基- C_1-C_4 烷基、杂芳基- C_1-C_4 烷基和杂环基- C_1-C_4 烷基, 其中后提到的 6 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的取代基;

R^1 为氢、CN、 C_1-C_{10} 烷基、 C_1-C_{10} 卤代烷基、 C_3-C_{10} 环烷基、 C_3-C_{10} 卤代环烷基、 C_2-C_{10} 链烯基、 C_2-C_{10} 卤代链烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_3-C_{10} 卤代炔基、 OR^a 、 $C(Y)R^b$ 、 $C(Y)OR^c$ 、 $S(O)_2R^d$ 、 NR^eR^f 、 $C(Y)NR^gR^h$ 、 $S(O)_mNR^eR^f$ 、 $C(Y)NR^iNR^eR^f$ 、苯基、杂芳基、杂环基、 C_1-C_5 亚烷基- OR^a 、 C_1-C_5 亚烷基-CN, 苯基- C_1-C_5 烷基、杂芳基- C_1-C_5 烷基、杂环基- C_1-C_5 烷基、 C_3-C_{10} 环烷基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 亚烷基- $C(Y)R^b$ 、 C_1-C_5 亚烷基- $C(Y)OR^c$ 、 C_1-C_5 亚烷基- NR^eR^f 、 C_1-C_5 亚烷基- $C(Y)NR^gR^h$ 、 C_1-C_5 亚烷基- $S(O)_2R^d$ 、 C_1-C_5 亚烷基- $S(O)_mNR^eR^f$ 、 C_1-C_5 亚烷基- $C(Y)NR^iNR^eR^f$, 其中后提到的 16 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自 R^x 或 R^y 的取代基;

m 为 0、1、2;

Y 为 O 或 S;

R^a 、 R^b 、 R^c 相互独立地选自氢、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 环烷基甲基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 卤代链烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基- C_1-C_4 烷基、杂芳基- C_1-C_4 烷基和杂环基- C_1-C_4 烷基, 其中后提到的 6 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的取代基;

R^d 选自 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 环烷基甲基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 卤代链烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基- C_1-C_4 烷基、杂芳基- C_1-C_4 烷基和杂环基- C_1-C_4 烷基, 其中后提到的 6 个基团中的环可

以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的取代基；

R^e、R^f 相互独立地选自氢、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 环烷基甲基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷基羰基、C₁-C₄ 卤代烷基羰基、C₁-C₄ 烷基磺酰基、C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基、苯基、苯基羰基、苯基磺酰基、杂芳基、杂芳基羰基、杂芳基磺酰基、杂环基、杂环基羰基、杂环基磺酰基、苯基 -C₁-C₄ 烷基、杂芳基 -C₁-C₄ 烷基和杂环基 -C₁-C₄ 烷基，其中后提到的 12 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的取代基；或者

R^e 和 R^f 与它们所键合的氮原子一起形成 5 或 6 员饱和或不饱和杂环，所述杂环可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员原子并且其中所述杂环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的取代基；

R^g、R^h 相互独立地选自氢、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基 -C₁-C₄ 烷基、杂芳基 -C₁-C₄ 烷基和杂环基 -C₁-C₄ 烷基，其中后提到的 6 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的取代基；

Rⁱ 选自氢、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 环烷基甲基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、苯基和苯基 -C₁-C₄ 烷基，其中后提到的 2 个基团中的苯基环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的取代基；

R^x 相互独立地选自氰基、硝基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₄ 卤代烷硫基、C₁-C₄ 烷基亚磺酰基、C₁-C₄ 卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄ 烷基磺酰基、C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基、C₁-C₁₀ 烷基羰基、C₃-C₆ 环烷基、5-7 员杂环基、苯基、C₃-C₆ 环烷氧基、3-6 员杂环氧基和苯氧基，其中后提到的 6 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个基团 R^y；以及其中

R^y 选自卤素、氰基、硝基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、S(O)_mR^d、S(O)_mNR^eR^f、C₁-C₄ 烷基羰基、C₁-C₄ 卤代烷基羰基、C₁-C₄ 烷氧羰基、C₁-C₄ 卤代烷氧羰基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 炔基和 C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基；

条件是当 W 为 N 时，R^v 为 H。

2. 如权利要求 1 所要求的化合物，其中所述哒嗪化合物为式 I 化合物。
3. 如权利要求 2 所要求的化合物，其中 X¹ 为氧。
4. 如权利要求 2 或 3 所要求的化合物，其中 R¹ 为氢、C₁-C₁₀ 烷基、C₁-C₁₀ 卤代烷基、C₁-C₄ 亚烷基 -CN、杂环基 -C₁-C₅ 烷基、杂芳基 -C₁-C₅ 烷基、C₁-C₅ 亚烷基 -OR^a 或 C₃-C₁₀ 环烷基 -C₁-C₅ 烷基。
5. 如权利要求 2 或 3 所要求的化合物，其中 R¹ 为氢、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基或 C₁-C₃

亚烷基 -O-C₁-C₃ 烷基。

6. 如权利要求 1-5 中任一项所要求的化合物,其中 W 为 CR^w,其中 R^w 为氢。

7. 如权利要求 1-6 中任一项所要求的化合物,其中 W 为 CR^w 并且其中 R^t、R^u 和 R^w 相互独立地选自氢、氟、氯、溴、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基和二氟甲氧基。

8. 如权利要求 1-7 中任一项所要求的化合物,其中基团 R^t、R^u、R^w 为氢。

9. 如权利要求 1-5 中任一项所要求的化合物,其中 W 为 N, R^v 为氢并且其中 R^t、R^u 相互独立地选自氢、氟、氯、溴、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基和二氟甲氧基。

10. 如权利要求 1-9 中任一项所要求的化合物,其中 A 为基团 A1。

11. 如权利要求 10 所要求的化合物,其中 (R^A)_n 选自氢、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基和 C₃-C₆ 卤代环烷基,其中 n 为 1 或 2。

12. 如权利要求 1-9 中任一项所要求的化合物,其中 A 为基团 A2。

13. 如权利要求 12 所要求的化合物,其中 (R^A)_n 选自氢、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基和 C₃-C₆ 卤代环烷基,其中 n 为 1 或 2。

14. 如权利要求 1-13 中任一项所要求的化合物,其中 A 中的 Z 为 NR^N,其中 R^N 选自 C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基 -C₁-C₄ 烷基、杂环基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、CN-C₁-C₄ 烷基。

15. 如权利要求 1-13 中任一项所要求的化合物,其中 A 中的 Z 为 O。

16. 如权利要求 1-13 中任一项所要求的化合物,其中 A 中的 Z 为 S。

17. 一种防治无脊椎动物害虫的方法,该方法包括用杀虫有效量的如权利要求 1-16 中任一项所定义的式 I 或 II 的哒嗪化合物或其盐或 N-氧化物处理害虫、其食物供应源、其栖息地或其繁殖地或其中害虫生长或可能生长的植物、种子、土壤、区域、材料或环境或者要防止害虫侵袭或侵染的材料、植物、种子、土壤、表面或空间。

18. 如权利要求 17 所要求的方法,其中所述无脊椎动物害虫为节肢动物害虫和 / 或线虫。

19. 如权利要求 18 所要求的方法,其中所述无脊椎动物害虫为同翅目昆虫。

20. 一种保护植物繁殖材料和 / 或由其生长的植物的方法,所述方法包括用杀虫有效量的如权利要求 1-16 中任一项所定义的式 I 或 II 的化合物或其可农用盐或 N-氧化物处理植物繁殖材料。

21. 植物繁殖材料,包含至少一种如权利要求 1-16 中任一项所定义的式 I 或 II 的化合物和 / 或其可农用盐或 N-氧化物。

防治无脊椎动物害虫的吡嗪化合物

[0001] 本发明涉及可以用于防除或防治无脊椎动物害虫,尤其是节肢动物害虫和线虫的新型吡嗪化合物、其非对映体、N-氧化物、盐或对映体或可农用或可兽用盐。本发明进一步涉及通过使用这些化合物防治无脊椎动物害虫的方法。本发明进一步涉及一种通过使用这些化合物保护植物繁殖材料和/或由其生长的植物的方法。本发明进一步涉及包含所述化合物的植物繁殖材料和农业和/或兽用组合物。

[0002] 无脊椎动物害虫,尤其是节肢动物和线虫破坏生长和收获的作物且袭击木质居住和商业结构体,从而对食物供应和财产造成大的经济损失。尽管已知大量杀虫剂,但由于目标害虫能够对所述杀虫剂产生耐药性,仍然需要用于防除无脊椎动物害虫如昆虫、蜘蛛和线虫的新试剂。因此,本发明的目的是提供具有良好的农药活性并且对大量不同的无脊椎动物害虫,尤其是难以防治的昆虫、蜘蛛和线虫显示出宽活性谱的化合物。

[0003] WO 2007/068373、WO 2007/068375 和 WO 2007/068377 描述了衍生于包含 5 或 6 员碳环或杂环的羧酸的 N-芳基-和 N-杂芳基酰胺的衍生物。提到这些化合物可以用于防治微生物。WO 2005/074686 和 WO2005/075411 描述了 N-芳基酰胺的衍生物,提到它们可以用于在植物保护中防治微生物如真菌、细菌。WO 2003/106427 描述了衍生于吡嗪羧酸的 N-芳基酰胺的衍生物。提到这些化合物可以用于防治无脊椎动物害虫。WO 2001/53259、WO 2001/49664 描述了吡咯衍生物,提到它们适合保护植物以防植物病原性微生物的侵染。

[0004] WO 2005/075452 和 DE 19649093 分别描述了 2-卤代咪喃基/噻吩基-3-羧酰胺的衍生物和 5-三氟甲基-4-芳基噻吩-2-羧酰胺衍生物。提到这些化合物可以用于防治不希望的微生物。WO 200153259 和 WO 200149664 描述了吡咯-3-羧酰胺化合物的衍生物并提到了它们作为杀真菌剂的用途。DE3933573 描述了咪喃和噻吩-2-羧酰胺衍生物及其作为除草剂的用途。

[0005] JP 2009078991 和 WO 2009106203 描述了噻吩羧酸衍生物化合物的制备并提到了其分别作为杀真菌剂和葡萄糖激酶活化剂的用途。

[0006] 本发明的目的是提供具有良好农药活性,尤其是杀虫活性并且对大量不同无脊椎动物害虫,尤其是难以防治的节肢动物害虫和/或线虫具有宽活性谱的化合物。

[0007] 已经发现这些目的可以通过如下所定义的式 I 和 II 的化合物、其立体异构体及其盐和 N-氧化物,尤其是其可农用或可兽用盐实现。

[0008] 因此,本发明第一方面涉及式 I 或 II 的吡嗪化合物或其可农用或可兽用盐、N-氧化物、对映体或非对映体:

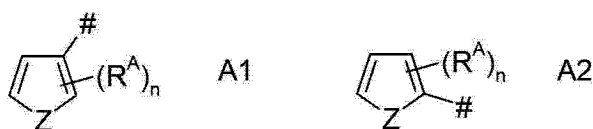
[0009]



[0010] 其中

[0011] A 为式 A1 或 A2 的咪喃或噻吩或吡咯基团:

[0012]



[0013] 其中 # 表示与式 I 或 II 的剩余部分的键合位置, 并且其中

[0014] n 为 0、1、2 或 3 ;

[0015] R^A 独立于整数 n 选自氢、卤素、CN、NO₂、C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 链烯基和 C₂-C₁₀ 炔基, 其中后提到的 3 个基团可以未被取代, 可以部分或完全被卤代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^x , 或者其中各 R^A 进一步相互独立地选自 OR^a、C(Y)R^b、C(Y)OR^c、S(O)_mR^d、NR^eR^f、杂环基、C₃-C₁₀ 环烷基和 C₅-C₁₀ 环烯基, 其中后提到的 3 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^x , 其中

[0016] Z 为 O、S 或 NR^N ;

[0017] V 为 C(R^v) 或 N ;

[0018] W 为 C(R^w) 或 N ;

[0019] 条件是 V 或 W 为 N ;

[0020] R^N 选自氢、CN、NO₂、C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 链烯基和 C₂-C₁₀ 炔基, 其中后提到的 3 个基团可以未被取代、可以部分或完全被卤代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^x , 或者其中 R^N 进一步选自 OR^a、C(Y)R^b、C(Y)OR^c、S(O)_mR^d、NR^eR^f、C(Y)NR^gR^h、S(O)_mNR^eR^f、C(Y)NRⁱNR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -OR^a、C₁-C₅ 亚烷基 -CN、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)R^b、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)OR^c、C₁-C₅ 亚烷基 -NR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)NR^gR^h、C₁-C₅ 亚烷基 -S(O)_mR^d、C₁-C₅ 亚烷基 -S(O)_mNR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -NRⁱNR^eR^f、杂环基、杂芳基、C₃-C₁₀ 环烷基、C₅-C₁₀ 环烯基、杂环基 -C₁-C₅ 烷基、杂芳基 -C₁-C₅ 烷基、C₃-C₁₀ 环烷基 -C₁-C₅ 烷基、C₅-C₁₀ 环烯基 -C₁-C₅ 烷基、苯基 -C₁-C₅ 烷基和苯基, 其中后提到的 10 个基团的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^y ,

[0021] R^t、R^u、R^v 和 R^w 相互独立地选自氢、卤素、C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₃ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₃ 卤代烷硫基、C₁-C₄ 烷基亚磺酰基、C₁-C₃ 卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄ 烷基磺酰基、C₁-C₃ 卤代烷基磺酰基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 炔基或 C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基 ;

[0022] X¹ 为 S、O 或 NR^{1a}, 其中 R^{1a} 选自氢、C₁-C₁₀ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₁₀ 环烷基、C₃-C₁₀ 环烷基甲基、C₃-C₁₀ 卤代环烷基、C₂-C₁₀ 链烯基、C₂-C₁₀ 卤代链烯基、C₂-C₁₀ 炔基、C₁-C₁₀ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、OR^a、苯基、杂芳基、杂环基、苯基 -C₁-C₄ 烷基、杂芳基 -C₁-C₄ 烷基、杂环基 -C₁-C₄ 烷基, 其中后提到的 6 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的取代基 ;

[0023] X² 为 OR^{2a}、NR^{2b}R^{2c}、S(O)_mR^{2d}, 其中 m 如上所定义, 其中 R^{2a} 选自 C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基 -C₁-C₄ 烷基、杂芳基 -C₁-C₄ 烷基和杂环基 -C₁-C₄ 烷基, 其中后提到的 6 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的取代基, 并且其中

[0024] R^{2b} 、 R^{2c} 相互独立地选自氢、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 卤代链烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基羰基、 C_1-C_4 卤代烷基羰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基、苯基、苯基羰基、苯基磺酰基、杂芳基、杂芳基羰基、杂芳基磺酰基、杂环基、杂环基羰基、杂环基磺酰基、苯基- C_1-C_4 烷基、杂芳基- C_1-C_4 烷基和杂环基- C_1-C_4 烷基，其中后提到的 12 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的取代基；或者

[0025] R^{2b} 和 R^{2c} 与它们所键合的氮原子一起形成 5 或 6 员饱和或不饱和杂环，所述杂环可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员原子并且其中所述杂环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的取代基，以及其中

[0026] R^{2d} 选自 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 卤代链烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基- C_1-C_4 烷基、杂芳基- C_1-C_4 烷基和杂环基- C_1-C_4 烷基，其中后提到的 6 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的取代基；

[0027] R^1 为氢、CN、 C_1-C_{10} 烷基、 C_1-C_{10} 卤代烷基、 C_3-C_{10} 环烷基、 C_3-C_{10} 卤代环烷基、 C_2-C_{10} 链烯基、 C_2-C_{10} 卤代链烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_3-C_{10} 卤代炔基、 OR^a 、 $C(Y)R^b$ 、 $C(Y)OR^c$ 、 $S(O)_2R^d$ 、 NR^eR^f 、 $C(Y)NR^gR^h$ 、 $S(O)_mNR^eR^f$ 、 $C(Y)NR^iNR^eR^f$ 、苯基、杂芳基、杂环基、 C_1-C_5 亚烷基- OR^a 、 C_1-C_5 亚烷基-CN、苯基- C_1-C_5 烷基、杂芳基- C_1-C_5 烷基、杂环基- C_1-C_5 烷基、 C_3-C_{10} 环烷基- C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 亚烷基- $C(Y)R^b$ 、 C_1-C_5 亚烷基- $C(Y)OR^c$ 、 C_1-C_5 亚烷基- NR^eR^f 、 C_1-C_5 亚烷基- $C(Y)NR^gR^h$ 、 C_1-C_5 亚烷基- $S(O)_2R^d$ 、 C_1-C_5 亚烷基- $S(O)_mNR^eR^d$ 、 C_1-C_5 亚烷基- $C(Y)NR^iNR^eR^f$ ，其中后提到的 16 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自 R^x 或 R^y 的取代基；

[0028] m 为 0、1、2；

[0029] Y 为 O 或 S；

[0030] R^a 、 R^b 、 R^c 相互独立地选自氢、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 环烷基甲基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 卤代链烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基- C_1-C_4 烷基、杂芳基- C_1-C_4 烷基和杂环基- C_1-C_4 烷基，其中后提到的 6 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的取代基；

[0031] R^d 选自 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 环烷基甲基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 卤代链烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基- C_1-C_4 烷基、杂芳基- C_1-C_4 烷基和杂环基- C_1-C_4 烷基，其中后提到的 6 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 卤代烷氧基的取代基；

[0032] R^e 、 R^f 相互独立地选自氢、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 环烷基甲基、 C_3-C_6 卤代环烷基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 卤代链烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷基羰基、 C_1-C_4 卤代烷基羰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基、苯基、苯基羰基、苯基磺酰基、杂芳基、杂芳基羰基、杂芳基磺酰基、杂环基、杂环基羰基、杂环基磺酰基

基、苯基 -C₁-C₄ 烷基、杂芳基 -C₁-C₄ 烷基和杂环基 -C₁-C₄ 烷基,其中后提到的 12 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的取代基;或者

[0033] R^e 和 R^f 与它们所键合的氮原子一起形成 5 或 6 员饱和或不饱和杂环,所述杂环可以带有选自 O、S 和 N 的另一杂原子作为环成员原子并且其中所述杂环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的取代基;

[0034] R^g、R^h 相互独立地选自氢、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基 -C₁-C₄ 烷基、杂芳基 -C₁-C₄ 烷基和杂环基 -C₁-C₄ 烷基,其中后提到的 6 个基团中的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的取代基;

[0035] Rⁱ 选自氢、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 环烷基甲基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 炔基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、苯基和苯基 -C₁-C₄ 烷基,其中后提到的 2 个基团中的苯基环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相互独立地选自卤素、氰基、硝基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的取代基;

[0036] R^x 相互独立地选自氰基、硝基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₄ 卤代烷硫基、C₁-C₄ 烷基亚磺酰基、C₁-C₄ 卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄ 烷基磺酰基、C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基、C₁-C₁₀ 烷基羰基、C₃-C₆ 环烷基、5-7 员杂环基、苯基、C₃-C₆ 环烷氧基、3-6 员杂环氧基和苯氧基,其中后提到的 6 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个基团 R^y;以及其中

[0037] R^y 选自卤素、氰基、硝基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、

[0038] C₁-C₄ 卤代烷氧基、S(O)_mR^d、S(O)_mNR^eR^f、C₁-C₄ 烷基羰基、C₁-C₄ 卤代烷基羰基、C₁-C₄ 烷氧羰基、C₁-C₄ 卤代烷氧羰基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₂-C₄ 链烯基、C₂-C₄ 卤代链烯基、C₂-C₄ 炔基和 C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基,其中 m 为 0、1 或 2 且 R^d 如上所定义;

[0039] 条件是当 W 为 N 时, R^v 为 H。

[0040] 本发明的另一方面涉及一种防治无脊椎动物害虫的方法,该方法包括用农药有效量的本发明式 I 或 II 的哒嗪化合物或其盐或 N-氧化物处理害虫、其食物供应源、其栖息地或其繁殖地或其中害虫生长或可能生长的栽培植物、植物繁殖材料如种子、土壤、区域、材料或环境或者要防止害虫侵袭或侵染的材料、植物、种子、土壤、表面或空间。

[0041] 本发明的另一方面涉及一种保护植物繁殖材料,尤其是种子,包含至少一种式 I 或 II 的化合物和/或由其生长的植物的方法,该方法包括用农药有效量的本发明式 I 或 II 的哒嗪化合物或其可农用盐或 N-氧化物处理植物繁殖材料。

[0042] 本发明的另一方面涉及包含至少一种本发明式 I 或 II 的哒嗪化合物和/或其可农用盐或 N-氧化物的植物繁殖材料。

[0043] 本发明的另一方面涉及一种处理或保护动物以防寄生虫,尤其是体外寄生虫侵染或感染的方法,该方法包括使所述动物与杀寄生虫有效量的本发明式 I 或 II 化合物或其可兽用盐或 N-氧化物接触。使动物与本发明化合物 I 或 II、其盐或兽用组合物接触是指将其

施用或给药于动物。

[0044] 本发明的另一方面涉及一种制备用于治疗性施用于被寄生虫侵染的动物上和/或动物中的可兽用盐的方法,其特征在于使用本发明的式 I 或 II 化合物或其可农用盐或 N-氧化物。

[0045] 本发明的另一方面涉及一种含有至少一种本发明式 I 或 II 化合物和/或其可农用盐和/或 N-氧化物和至少一种液体或固体载体的农业组合物。

[0046] 取决于取代方式,式 I 或 II 化合物可以具有一个或多个手性中心,此时它们以对映体或非对映体的混合物存在。本发明提供了纯对映体或非对映体及其混合物二者以及化合物 I 的纯对映体或非对映体或其混合物的本发明用途。合适的式 I 或 II 化合物还包括所有可能的几何立体异构体(顺式/反式异构体)及其混合物。顺式/反式异构体可以相对于例如亚胺基团存在。

[0047] 式 I 或 II 化合物可以是无定形的或者可以以一种或多种不同的晶态存在(多晶形),这些不同的晶态可能具有不同的宏观性能如稳定性或显示不同生物学性能如活性。本发明包括无定形和结晶的式 I 或 II 化合物、相应化合物 I 或 II 的不同晶态的混合物及其无定形或结晶盐。

[0048] 式 I 或 II 化合物的盐优选为可农用盐和可兽用盐。它们可以常规方法形成,例如若式 I 或 II 化合物具有碱性官能团,则通过使该化合物与酸反应或者若式 I 或 II 化合物具有酸性官能团,则通过使该化合物与合适的碱反应。

[0049] 合适的可农用盐尤其为其阳离子和阴离子分别对本发明化合物的杀虫作用没有不利影响的的那些阳离子的盐或那些酸的酸加成盐。合适的阳离子尤其是碱金属离子,优选锂、钠和钾离子;碱土金属离子,优选钙、镁和钡离子;过渡金属离子,优选锰、铜、锌和铁离子;还有铵离子(NH_4^+)和其中 1-4 个氢原子被 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 羟基烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、羟基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、苯基或苄基替代的取代铵离子。取代铵离子的实例包括甲基铵、异丙基铵、二甲基铵、二异丙基铵、三甲基铵、四甲基铵、四乙基铵、四丁基铵、2-羟基乙基铵、2-(2-羟基乙氧基)乙基铵、二(2-羟基乙基)铵、苄基三甲基铵和苄基三乙基铵,此外还有磷离子,铈离子,优选三($\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基)铈和氧化铈离子,优选三($\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基)氧化铈。

[0050] 有用酸加成盐的阴离子主要是氯离子、溴离子、氟离子、硫酸氢根、硫酸根、磷酸二氢根、磷酸氢根、磷酸根、硝酸根、碳酸氢根、碳酸根、六氟硅酸根、六氟磷酸根、苯甲酸根和 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 链烷酸的阴离子,优选甲酸根、乙酸根、丙酸根和丁酸根。它们可以通过使式 I 和 II 化合物与对应阴离子的酸,优选盐酸、氢溴酸、硫酸、磷酸或硝酸反应而形成。

[0051] 式 I 和 II 化合物的可兽用盐尤其包括在兽用盐形成领域已知且被接受的酸加成盐。例如通过含碱性氮原子如氨基的式 I 或 II 化合物形成的合适酸加成盐包括与无机酸的盐,如盐酸盐、硫酸盐、磷酸盐和硝酸盐,以及有机酸如乙酸、马来酸(例如马来酸单盐或二盐)、二马来酸、富马酸(例如富马酸单盐或二盐)、二富马酸盐、甲烷次磺酸、甲烷磺酸和琥珀酸的盐。

[0052] 术语“N-氧化物”包括具有至少一个被氧化成 N-氧化物结构部分的叔氮原子的任何式 I 或 II 化合物。

[0053] 本文所用术语“无脊椎动物害虫”包括动物种群,如可能侵袭植物,从而对受侵袭

的植物产生显著损害的昆虫、蜘蛛和线虫,以及可能侵染动物,尤其是温血动物,如哺乳动物或鸟类或其他高等动物如爬行动物、两栖动物或鱼类,从而对受侵染的动物产生显著损害的体外寄生虫。

[0054] 本文所用术语“植物繁殖材料”包括植物的所有繁殖部分如种子,以及可以用于繁殖植物的无性植物材料如插条和块茎(例如土豆)。这包括种子、根、果实、块茎、球茎、地下茎、嫩枝、芽和其他植物部分。还可包括在萌发后或出苗后由土壤移植的秧苗和幼苗。这些植物繁殖材料可以在种植或移栽之时或之前用植物保护化合物预防性处理。

[0055] 术语“植物”包括任何类型的植物,这包括“非栽培植物”和尤其是“栽培植物”。

[0056] 术语“非栽培植物”是指任何野生类型的品种或相关品种或者栽培植物的相关属。

[0057] 本文所用术语“栽培植物”包括已经通过育种、诱变或基因工程修饰的植物。基因修饰植物是其基因材料通过使用在自然条件下不易通过杂交、突变或自然重组得到的重组DNA技术修饰的植物。通常将一个或多个基因整合到基因修饰植物的基因材料中以改善植物的某些性能。这类基因修饰还包括但不限于蛋白质(寡肽或多肽)的靶向翻译后修饰,例如通过糖基化或聚合物加成如异戊二烯化、乙酰化或法呢基化结构部分或PEG结构部分(例如如Biotechnol Prog. 2001年7月至8月;17(4):720-8,Protein Eng Des Sel. 2004年1月;17(1):57-66, Nat Protoc. 2007;2(5):1225-35, Curr Opin Chem Biol. 2006年10月;10(5):487-91, 2006年8月28日 Epub, Biomaterials. 2001年3月;22(5):405-17, Bioconjug Chem. 2005年1-2月;16(1):113-21所公开)。

[0058] 本文所用术语“栽培植物”进一步包括例如已经因常规育种或基因工程方法而耐受特殊类别的除草剂施用的植物,例如羟基苯基丙酮酸双加氧酶(HPPD)抑制剂;乙酰乳酸合成酶(ALS)抑制剂如磺酰脲类(例如见US6,222,100、WO 01/82685、WO 00/26390、WO 97/41218、WO 98/02526、WO 98/02527、WO 04/106529、WO 05/20673、WO 03/14357、WO 03/13225、WO 03/14356、WO 04/16073)或咪唑啉酮类(例如见US 6,222,100、WO01/82685、WO 00/26390、WO 97/41218、WO 98/002526、WO 98/02527、WO 04/106529、WO 05/20673、WO 03/014357、WO 03/13225、WO03/14356、WO 04/16073);烯醇丙酮酰莽草酸3-磷酸合成酶(EPSPS)抑制剂如草甘膦(glyphosate)(例如见WO 92/00377);谷氨酰胺合成酶(GS)抑制剂如草铵膦(glufosinate)(例如见EP-A 242 236、EP-A 242 246)或oxynil除草剂(例如见US 5,559,024)。几种栽培植物已经通过常规育种(诱变)方法而耐受除草剂,例如**Clearfield**[®]夏播油菜(Canola)耐受咪唑啉酮类如咪草啶酸(imazamox)。基因工程方法已经用于使栽培植物如大豆、棉花、玉米、甜菜和油菜耐受除草剂如草甘膦和草铵膦,它们中的一些可以以商品名**RoundupReady**[®](耐受草甘膦)和**LibertyLink**[®](耐受草铵膦)市购。

[0059] 本文所用术语“栽培植物”进一步包括通过使用重组DNA技术而能够合成一种或多种杀虫蛋白的植物,该蛋白尤其是由芽孢杆菌属(Bacillus)细菌已知的那些,特别是由苏云金芽孢杆菌(Bacillus thuringiensis)已知的那些,例如 δ -内毒素如CryIA(b)、CryIA(c)、CryIF、CryIF(a2)、CryIIA(b)、CryIIIA、CryIIIB(b1)或Cry9c;无性杀虫蛋白(VIP)如VIP1、VIP2、VIP3或VIP3A;线虫定居细菌的杀虫蛋白如发光杆菌属(Photobacterium)或致病杆菌属(Xenorhabdus);动物产生的毒素如蝎毒素、蜘蛛毒素、黄蜂毒素或其他昆虫特异性神经毒素;真菌产生的毒素如链霉菌属(Streptomyces)毒素,植

物凝集素如豌豆或大麦凝集素；凝集素；蛋白酶抑制剂如胰蛋白酶抑制剂、丝氨酸蛋白酶抑制剂、patatin、半胱氨酸蛋白酶抑制剂或木瓜蛋白酶抑制剂；核糖体失活蛋白 (RIP) 如蓖麻蛋白、玉米-RIP、相思豆毒蛋白、丝瓜籽蛋白、皂草素或异株腹泻毒蛋白 (bryodin)；类固醇代谢酶如 3-羟基类固醇氧化酶、蜕皮甾类-IDP 糖基转移酶、胆固醇氧化酶、蜕皮激素抑制剂或 HMG-CoA 还原酶；离子通道阻断剂如钠通道或钙通道阻断剂；保幼激素酯酶；利尿激素受体 (helicokinin 受体)；芪合成酶，联苄合成酶，壳多糖酶或葡聚糖酶。就本发明而言，这些杀虫蛋白或毒素还具体理解为前毒素、杂合蛋白、截短的或其他方面改性的蛋白。杂合蛋白的特征在于蛋白域的新型组合 (例如见 WO 02/015701)。该类毒素或能够合成该类毒素的基因修饰植物的其他实例公开于例如 EP-A 374 753、WO 93/007278、WO 95/34656、EP-A 427 529、EP-A 451 878、WO 03/18810 和 W003/052073 中。

[0060] 生产该类基因修饰植物的方法对本领域熟练技术人员通常是已知的且例如描述于上述出版物中。这些含于基因修饰植物中的杀虫蛋白赋予产生这些蛋白的植物以对某些分类学上为节肢动物昆虫的害虫，尤其是甲虫 (鞘翅目 (Coleoptera))、蝇 (双翅目 (Diptera))、蝴蝶和蛾 (鳞翅目 (Lepidoptera)) 以及植物寄生线虫 (线虫纲 (Nematoda)) 的耐受性。

[0061] 本文所用术语“栽培植物”进一步包括通过使用重组 DNA 技术而能够合成一种或多种蛋白以增加其对细菌、病毒或真菌病原体的抗性或耐受性的植物。这类蛋白的实例是所谓的“与发病机理相关的蛋白”(PR 蛋白，例如见 EP-A 0 392 225)，植物病害抗性基因 (例如表达针对来自野生墨西哥土豆 *Solanum bulbocastanum* 的致病疫霉 (*Phytophthora infestans*) 的抗性基因的土豆栽培品种) 或 T4 溶菌酶 (例如能够合成对细菌如 *Erwinia amylovora* 具有增强抗性的这些蛋白的土豆栽培品种)。

[0062] 本文所用术语“栽培植物”进一步包括通过使用重组 DNA 技术而能够合成一种或多种蛋白以提高产量 (例如生物质产量、谷粒产量、淀粉含量、油含量或蛋白含量)，对于干旱、盐或其他限制生长的环境因素的耐受性或对害虫以及真菌、细菌或其病毒病原体的耐受性的植物。

[0063] 本文所用术语“栽培植物”进一步包括通过使用重组 DNA 技术而含有改变量的物质含量或新物质含量以尤其改善人类或动物营养的植物，例如产生促进健康的长链 ω -3 脂肪酸或不饱和 ω -9 脂肪酸的油料作物 (例如 **Nexera**[®] 油菜)。

[0064] 本文所用术语“栽培植物”进一步包括通过使用重组 DNA 技术而含有改变量的物质含量或新物质含量以尤其改善原料生产的植物，例如产生增加量的支链淀粉的土豆 (例如 **Amflora**[®] 土豆)。

[0065] 在各变量的上述定义中提到的有机结构部分象术语卤素一样为各基团成员的各次列举的集合性术语。前缀 C_x-C_y 在每种情况下表示该基团中可能的碳原子数。

[0066] 术语卤素在每种情况下表示氟、溴、氯或碘，尤其是氟、氯或溴。

[0067] 本文所用以及在烷氧基、烷基羰基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基和烷氧基烷基的烷基结构部分中的术语“烷基”在每种情况下表示通常具有 1-10 个碳原子，常常具有 1-6 个碳原子，优选 1-4 个碳原子，尤其是 1-3 碳原子的直链或支化烷基。烷基的实例是甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、2-丁基、异丁基、叔丁基、正戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、正己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙

基、1- 甲基戊基、2- 甲基戊基、3- 甲基戊基、4- 甲基戊基、1, 1- 二甲基丁基、1, 2- 二甲基丁基、1, 3- 二甲基丁基、2, 2- 二甲基丁基、2, 3- 二甲基丁基、3, 3- 二甲基丁基、1- 乙基丁基、2- 乙基丁基、1, 1, 2- 三甲基丙基、1, 2, 2- 三甲基丙基、1- 乙基-1- 甲基丙基、1- 乙基-2- 甲基丙基、正庚基、1- 甲基己基、2- 甲基己基、3- 甲基己基、4- 甲基己基、5- 甲基己基、1- 乙基戊基、2- 乙基戊基、3- 乙基戊基、1- 丙基戊基、正辛基、1- 甲基辛基、2- 甲基庚基、1- 乙基己基、2- 乙基己基、1, 2- 二甲基己基、1- 丙基戊基和 2- 丙基戊基。

[0068] 本文所用术语“ C_1-C_{10} 卤代烷基”一也表达为“可以被卤素取代的 C_1-C_{10} 烷基”是指具有 1-2 个 (“ C_1-C_2 卤代烷基”)、1-4 个 (“ C_1-C_4 卤代烷基”)、1-6 个 (“ C_1-C_6 卤代烷基”)、1-8 个 (“ C_1-C_8 卤代烷基”) 或 1-10 个 (“ C_1-C_{10} 卤代烷基”) 碳原子的直链或支化烷基 (如上所述), 其中这些基团中的部分或所有氢原子被上述卤原子替代: 尤其是 C_1-C_2 卤代烷基, 如氯甲基、溴甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯一氟甲基、一氯二氟甲基、1- 氯乙基、1- 溴乙基、1- 氟乙基、2- 氟乙基、2, 2- 二氟乙基、2, 2, 2- 三氟乙基、2- 氯-2- 氟乙基、2- 氯-2, 2- 二氟乙基、2, 2- 二氯-2- 氟乙基、2, 2, 2- 三氯乙基、五氟乙基或 1, 1, 1- 三氟丙-2- 基。“卤代甲基”是其中 1, 2 或 3 个氢原子被卤原子替代的甲基。实例是溴甲基、氯甲基、氟甲基、二氯甲基、三氯甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯一氟甲基、一氯二氟甲基等。

[0069] 本文所用以及在链烯氧基等的链烯基结构部分中的术语“ C_2-C_6 链烯基”是指具有 2-4 个 (“ C_2-C_4 链烯基”) 或 2-6 个 (“ C_2-C_6 链烯基”) 碳原子和在任意位置的双键的单不饱和直链或支化烃基, 例如 C_2-C_4 链烯基, 如乙烯基、1- 丙烯基、2- 丙烯基、1- 甲基乙烯基、1- 丁烯基、2- 丁烯基、3- 丁烯基、1- 甲基-1- 丙烯基、2- 甲基-1- 丙烯基、1- 甲基-2- 丙烯基或 2- 甲基-2- 丙烯基; C_2-C_6 链烯基, 如乙烯基、1- 丙烯基、2- 丙烯基、1- 甲基乙烯基、1- 丁烯基、2- 丁烯基、3- 丁烯基、1- 甲基-1- 丙烯基、2- 甲基-1- 丙烯基、1- 甲基-2- 丙烯基、2- 甲基-2- 丙烯基、1- 戊烯基、2- 戊烯基、3- 戊烯基、4- 戊烯基、1- 甲基-1- 丁烯基、2- 甲基-1- 丁烯基、3- 甲基-1- 丁烯基、1- 甲基-2- 丁烯基、2- 甲基-2- 丁烯基、3- 甲基-2- 丁烯基、1- 甲基-3- 丁烯基、2- 甲基-3- 丁烯基、3- 甲基-3- 丁烯基、1, 1- 二甲基-2- 丙烯基、1, 2- 二甲基-1- 丙烯基、1, 2- 二甲基-2- 丙烯基、1- 乙基-1- 丙烯基、1- 乙基-2- 丙烯基、1- 己烯基、2- 己烯基、3- 己烯基、4- 己烯基、5- 己烯基、1- 甲基-1- 戊烯基、2- 甲基-1- 戊烯基、3- 甲基-1- 戊烯基、4- 甲基-1- 戊烯基、1- 甲基-2- 戊烯基、2- 甲基-2- 戊烯基、3- 甲基-2- 戊烯基、4- 甲基-2- 戊烯基、1- 甲基-3- 戊烯基、2- 甲基-3- 戊烯基、3- 甲基-3- 戊烯基、4- 甲基-3- 戊烯基、1- 甲基-4- 戊烯基、2- 甲基-4- 戊烯基、3- 甲基-4- 戊烯基、4- 甲基-4- 戊烯基、1, 1- 二甲基-2- 丁烯基、1, 1- 二甲基-3- 丁烯基、1, 2- 二甲基-1- 丁烯基、1, 2- 二甲基-2- 丁烯基、1, 2- 二甲基-3- 丁烯基、1, 3- 二甲基-1- 丁烯基、1, 3- 二甲基-2- 丁烯基、1, 3- 二甲基-3- 丁烯基、2, 2- 二甲基-3- 丁烯基、2, 3- 二甲基-1- 丁烯基、2, 3- 二甲基-2- 丁烯基、2, 3- 二甲基-3- 丁烯基、3, 3- 二甲基-1- 丁烯基、3, 3- 二甲基-2- 丁烯基、1- 乙基-1- 丁烯基、1- 乙基-2- 丁烯基、1- 乙基-3- 丁烯基、2- 乙基-1- 丁烯基、2- 乙基-2- 丁烯基、2- 乙基-3- 丁烯基、1, 1, 2- 三甲基-2- 丙烯基、1- 乙基-1- 甲基-2- 丙烯基、1- 乙基-2- 甲基-2- 丙烯基等及其位置异构体。

[0070] 本文所用术语“ C_2-C_6 卤代链烯基”一也表达为“可以被卤素取代的 C_2-C_6 链烯基”

以及卤代链烯氧基、卤代链烯基羰基等中的卤代链烯基结构部分是指具有 2-4 个 (“ C_2-C_4 卤代链烯基”) 或 2-6 个 (“ C_2-C_6 卤代链烯基”) 碳原子和在任意位置的双键的不饱和直链或支化烃基 (如上所述), 其中这些基团中的部分或所有氢原子被上述卤原子, 尤其是氟、氯和溴替代, 例如氯乙烯基、氯代烯丙基等。

[0071] 本文所用术语“炔基”在每种情况下表示通常具有 2-10 个, 优选 2-4 个碳原子的单不饱和烃基, 例如乙炔基、炔丙基 (2-丙炔-1-基)、1-丙炔-1-基、1-甲基丙-2-炔-1-基)、2-丁炔-1-基、3-丁炔-1-基、1-戊炔-1-基、3-戊炔-1-基、4-戊炔-1-基、1-甲基丁-2-炔-1-基、1-乙基丙-2-炔-1-基等。

[0072] 本文所用术语“ C_2-C_6 炔基”以及炔氧基、炔基羰基等中的炔基结构部分是指具有 2-4 个 (“ C_2-C_4 炔基”)、2-6 个 (“ C_2-C_6 炔基”)、2-8 个 (“ C_2-C_8 炔基”) 或 2-10 个 (“ C_2-C_{10} 炔基”) 碳原子和在任意位置的一个或两个叁键的直链或支化烃基, 例如 C_2-C_4 炔基, 如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基等, C_2-C_6 炔基, 如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、3-甲基-1-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基、1-乙基-2-丙炔基、1-己炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、1-甲基-2-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-3-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、3-甲基-1-戊炔基、3-甲基-4-戊炔基、4-甲基-1-戊炔基、4-甲基-2-戊炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-3-丁炔基、1,2-二甲基-3-丁炔基、2,2-二甲基-3-丁炔基、3,3-二甲基-1-丁炔基、1-乙基-2-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-乙基-3-丁炔基、1-乙基-1-甲基-2-丙炔基等;

[0073] 本文所用术语“ C_2-C_6 卤代炔基”一也表达为“可以被卤素取代的 C_2-C_6 炔基”以及卤代炔氧基、卤代炔基羰基等中的卤代炔基结构部分是指具有 2-4 个 (“ C_2-C_4 卤代炔基”)、3-4 个 (“ C_3-C_4 卤代炔基”)、2-6 个 (“ C_2-C_6 卤代炔基”)、3-6 个 (“ C_3-C_6 卤代炔基”) 个碳原子和在任意位置的一个或两个叁键的不饱和直链或支化烃基 (如上所述), 其中这些基团中的部分或所有氢原子被上述卤原子, 尤其是氟、氯和溴替代;

[0074] 本文所用术语“亚烷基”(或链烷二基)在每种情况下表示如上所定义的烷基, 其中在碳骨架的任何位置处的一个氢原子被另一个连接位置替代, 从而形成二价结构部分。

[0075] 术语“ C_1-C_2 烷氧基”为经由氧原子连接的如上所定义的 C_1-C_2 烷基。术语“ C_1-C_4 烷氧基”为经由氧原子连接的如上所定义的 C_1-C_4 烷基。术语“ C_1-C_6 烷氧基”为经由氧原子连接的如上所定义的 C_1-C_6 烷基。 C_1-C_2 烷氧基为甲氧基或乙氧基。 C_1-C_4 烷氧基额外例如为正丙氧基、1-甲基乙氧基 (异丙氧基)、丁氧基、1-甲基丙氧基 (仲丁氧基)、2-甲基丙氧基 (异丁氧基) 或 1,1-二甲基乙氧基 (叔丁氧基)。 C_1-C_6 烷氧基额外例如为戊氧基、1-甲基丁氧基、2-甲基丁氧基、3-甲基丁氧基、1,1-二甲基丙氧基、1,2-二甲基丙氧基、2,2-二甲基丙氧基、1-乙基丙氧基、己氧基、1-甲基戊氧基、2-甲基戊氧基、3-甲基戊氧基、4-甲基戊氧基、1,1-二甲基丁氧基、1,2-二甲基丁氧基、1,3-二甲基丁氧基、2,2-二甲基丁氧基、2,3-二甲基丁氧基、3,3-二甲基丁氧基、1-乙基丁氧基、2-乙基丁氧基、1,1,2-三甲基丙氧基、1,2,2-三甲基丙氧基、1-乙基-1-甲基丙氧基或 1-乙基-2-甲基丙氧基。

[0076] 术语“ C_1-C_2 卤代烷氧基”为经由氧原子连接的如上所定义的 C_1-C_2 卤代烷基。术语“ C_1-C_4 卤代烷氧基”为经由氧原子连接的如上所定义的 C_1-C_4 卤代烷基。术语“ C_1-C_6

卤代烷氧基”为经由氧原子连接的如上所定义的 C_1-C_6 卤代烷基。 C_1-C_2 卤代烷氧基例如为 OCH_2F 、 $OCHF_2$ 、 OCF_3 、 OCH_2Cl 、 $OCHCl_2$ 、 $OCCl_3$ 、氯氟甲氧基、二氯一氟甲氧基、一氯二氟甲氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2-溴乙氧基、2-碘乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基或 OC_2F_5 。 C_1-C_4 卤代烷氧基额外例如为 2-氟丙氧基、3-氟丙氧基、2,2-二氟丙氧基、2,3-二氟丙氧基、2-氯丙氧基、3-氯丙氧基、2,3-二氯丙氧基、2-溴丙氧基、3-溴丙氧基、3,3,3-三氟丙氧基、3,3,3-三氯丙氧基、 $OCH_2-C_2F_5$ 、 $OCF_2-C_2F_5$ 、1-(CH_2F)-2-氟乙氧基、1-(CH_2Cl)-2-氯乙氧基、1-(CH_2Br)-2-溴乙氧基、4-氟丁氧基、4-氯丁氧基、4-溴丁氧基或九氟丁氧基。 C_1-C_6 卤代烷氧基额外例如为 5-氟戊氧基、5-氯戊氧基、5-溴戊氧基、5-碘戊氧基、十一氟戊氧基、6-氟己氧基、6-氯己氧基、6-溴己氧基、6-碘己氧基或十二氟己氧基。

[0077] 本文所用以及在环烷氧基和环烷基甲基的环烷基结构部分中的术语“环烷基”在每种情况下表示通常具有 3-10 个碳原子或 3-6 个碳原子的单环或双环脂环族基团，如环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、双环 [2.1.1] 己基、双环 [3.1.1] 庚基、双环 [2.2.1] 庚基和双环 [2.2.2] 辛基。

[0078] 本文所用术语“ C_n-C_m 环烯基”等是指具有 $n-m$ 个（例如 2-4 个（“ C_2-C_4 链烯基”）或 2-6 个（“ C_2-C_6 链烯基”））碳原子和在任意位置的双键的单不饱和直链或支化烃基。

[0079] 本文所用以及在卤代环烷基甲基的卤代环烷基结构部分中的术语“卤代环烷基”在每种情况下表示通常具有 3-10 个碳原子或 3-6 个碳原子的单环或双环脂环族基团，其中至少一个，例如 1、2、3、4 或 5 个氢原子被卤素，尤其是氟、氯或溴替代。实例是 1-和 2-氟环丙基，1,2-、2,2-和 2,3-二氟环丙基，1,2,2-三氟环丙基，2,2,3,3-四氟环丙基，1-和 2-氯环丙基，1,2-、2,2-和 2,3-二氯环丙基，1,2,2-三氯环丙基，2,2,3,3-四氯环丙基，1-、2-和 3-氟环戊基，1,2-、2,2-、2,3-、3,3-、3,4-、2,5-二氟环戊基，1-、2-和 3-氯环戊基，1,2-、2,2-、2,3-、3,3-、3,4-、2,5-二氯环戊基等。

[0080] 术语“ C_3-C_6 环烷基- C_1-C_3 烷基”是指经由如上所定义的 C_1-C_3 烷基与该分子的其余部分键合的如上所定义的 C_3-C_6 环烷基。实例是环丙基甲基、环丙基乙基、环丙基丙基、环丁基甲基、环丁基乙基、环丁基丙基、环戊基甲基、环戊基乙基、环戊基丙基、环己基甲基、环己基乙基、环己基丙基等。

[0081] 本文所用术语“ C_n-C_m 环烷基- C_o-C_p 烷基”或“环烷基烷基”等是指经由具有 $o-p$ 个碳原子的如上所定义的烷基与该分子的其余部分键合的具有 $n-m$ 个碳原子的如上所定义环烷基。

[0082] 本文所用术语“烷氧基烷基”是指通常包含 1-4 个碳原子的烷基，其中 1 个碳原子带有通常包含 1-10 个，尤其是 1-4 个碳原子的如上所定义的烷氧基。实例是 CH_2OCH_3 、 $CH_2-OC_2H_5$ 、正丙氧基甲基、 $CH_2-OCH(CH_3)_2$ 、正丁氧基甲基、(1-甲基丙氧基)甲基、(2-甲基丙氧基)甲基、 $CH_2-OC(CH_3)_3$ 、2-甲氧基乙基、2-乙氧基乙基、2-正丙氧基乙基、2-(1-甲基乙氧基)乙基、2-(正丁氧基)乙基、2-(1-甲基丙氧基)乙基、2-(2-甲基丙氧基)乙基、2-(1,1-二甲基乙氧基)乙基、2-甲氧基丙基、2-乙氧基丙基、2-正丙氧基丙基、2-(1-甲基乙氧基)丙基、2-(正丁氧基)丙基、2-(1-甲基丙氧基)丙基、2-(2-甲基丙氧基)丙基、2-(1,1-二甲基乙氧基)丙基、3-甲氧基丙基、3-乙氧基丙基、3-正丙氧基丙基、3-(1-甲基乙氧基)丙基、3-(正丁氧基)丙基、3-(1-甲基丙氧基)丙基、3-(2-甲基丙氧基)丙基、

3-(1,1-二甲基乙氧基)丙基、2-甲氧基丁基、2-乙氧基丁基、2-正丙氧基丁基、2-(1-甲基乙氧基)丁基、2-(正丁氧基)丁基、2-(1-甲基丙氧基)丁基、2-(2-甲基丙氧基)丁基、2-(1,1-二甲基乙氧基)丁基、3-甲氧基丁基、3-乙氧基丁基、3-正丙氧基丁基、3-(1-甲基乙氧基)丁基、3-(正丁氧基)丁基、3-(1-甲基丙氧基)丁基、3-(2-甲基丙氧基)丁基、3-(1,1-二甲基乙氧基)丁基、4-甲氧基丁基、4-乙氧基丁基、4-正丙氧基丁基、4-(1-甲基乙氧基)丁基、4-(正丁氧基)丁基、4-(1-甲基丙氧基)丁基、4-(2-甲基丙氧基)丁基、4-(1,1-二甲基乙氧基)丁基等。

[0083] 本文所用术语“烷基羰基”(烷基-C(=O)-)是指通过在烷基中的任何位置的羰基的碳原子连接的包含1-10个碳原子(=C₁-C₁₀烷基羰基),优选1-4个碳原子(=C₁-C₄烷基羰基)的如上所定义的直链或支化饱和烷基。

[0084] 本文所用术语“卤代烷基羰基”是指如上所定义的烷基羰基,其中氢原子部分或全部被氟、氯、溴和/或碘替代。

[0085] 术语“C₁-C₂烷硫基”是经由硫原子连接的如上所定义的C₁-C₂烷基。术语“C₁-C₄烷硫基”是经由硫原子连接的如上所定义的C₁-C₄烷基。术语“C₁-C₆烷硫基”是经由硫原子连接的如上所定义的C₁-C₆烷基。C₁-C₂烷硫基是甲硫基或乙硫基。C₁-C₄烷硫基额外例如为正丙硫基、1-甲基乙硫基(异丙硫基)、丁硫基、1-甲基丙硫基(仲丁硫基)、2-甲基丙硫基(异丁硫基)或1,1-二甲基乙硫基(叔丁硫基)。C₁-C₆烷硫基额外例如为戊硫基、1-甲基丁硫基、2-甲基丁硫基、3-甲基丁硫基、1,1-二甲基丙硫基、1,2-二甲基丙硫基、2,2-二甲基丙硫基、1-乙基丙硫基、己硫基、1-甲基戊硫基、2-甲基戊硫基、3-甲基戊硫基、4-甲基戊硫基、1,1-二甲基丁硫基、1,2-二甲基丁硫基、1,3-二甲基丁硫基、2,2-二甲基丁硫基、2,3-二甲基丁硫基、3,3-二甲基丁硫基、1-乙基丁硫基、2-乙基丁硫基、1,1,2-三甲基丙硫基、1,2,2-三甲基丙硫基、1-乙基-1-甲基丙硫基或1-乙基-2-甲基丙硫基。

[0086] 术语“C₁-C₂卤代烷硫基”为经由硫原子连接的如上所定义的C₁-C₂卤代烷基。术语“C₁-C₄卤代烷硫基”为经由硫原子连接的如上所定义的C₁-C₄卤代烷基。术语“C₁-C₆卤代烷硫基”为经由硫原子连接的如上所定义的C₁-C₆卤代烷基。C₁-C₂卤代烷硫基例如为SCH₂F、SCHF₂、SCF₃、SCH₂Cl、SCHCl₂、SCCl₃、氯氟甲硫基、二氯一氟甲硫基、一氯二氟甲硫基、2-氟乙硫基、2-氯乙硫基、2-溴乙硫基、2-碘乙硫基、2,2-二氟乙硫基、2,2,2-三氟乙硫基、2-氯-2-氟乙硫基、2-氯-2,2-二氟乙硫基、2,2-二氯-2-氟乙硫基、2,2,2-三氯乙硫基或SC₂F₅。C₁-C₄卤代烷硫基额外例如为2-氟丙硫基、3-氟丙硫基、2,2-二氟丙硫基、2,3-二氟丙硫基、2-氯丙硫基、3-氯丙硫基、2,3-二氯丙硫基、2-溴丙硫基、3-溴丙硫基、3,3,3-三氟丙硫基、3,3,3-三氯丙硫基、SCH₂-C₂F₅、SCF₂-C₂F₅、1-(CH₂F)-2-氟乙硫基、1-(CH₂Cl)-2-氯乙硫基、1-(CH₂Br)-2-溴乙硫基、4-氟丁硫基、4-氯丁硫基、4-溴丁硫基或九氟丁硫基。C₁-C₆卤代烷硫基额外例如为5-氟戊硫基、5-氯戊硫基、5-溴戊硫基、5-碘戊硫基、十一氟戊硫基、6-氟己硫基、6-氯己硫基、6-溴己硫基、6-碘己硫基或十二氟己硫基。

[0087] 术语“C₁-C₂烷基亚磺酰基”为经由亚磺酰基[S(O)]连接的如上所定义的C₁-C₂烷基。术语“C₁-C₄烷基亚磺酰基”为经由亚磺酰基[S(O)]连接的如上所定义的C₁-C₄烷基。术语“C₁-C₆烷基亚磺酰基”为经由亚磺酰基[S(O)]连接的如上所定义的C₁-C₆烷基。C₁-C₂烷基亚磺酰基为甲基亚磺酰基或乙基亚磺酰基。C₁-C₄烷基亚磺酰基额外例如为正丙基亚磺酰基、1-甲基乙基亚磺酰基(异丙基亚磺酰基)、丁基亚磺酰基、1-甲基丙基亚磺酰基(仲

丁基亚磺酰基)、2-甲基丙基亚磺酰基(异丁基亚磺酰基)或1,1-二甲基乙基亚磺酰基(叔丁基亚磺酰基)。C₁-C₆烷基亚磺酰基额外例如为戊基亚磺酰基、1-甲基丁基亚磺酰基、2-甲基丁基亚磺酰基、3-甲基丁基亚磺酰基、1,1-二甲基丙基亚磺酰基、1,2-二甲基丙基亚磺酰基、2,2-二甲基丙基亚磺酰基、1-乙基丙基亚磺酰基、己基亚磺酰基、1-甲基戊基亚磺酰基、2-甲基戊基亚磺酰基、3-甲基戊基亚磺酰基、4-甲基戊基亚磺酰基、1,1-二甲基丁基亚磺酰基、1,2-二甲基丁基亚磺酰基、1,3-二甲基丁基亚磺酰基、2,2-二甲基丁基亚磺酰基、2,3-二甲基丁基亚磺酰基、3,3-二甲基丁基亚磺酰基、1-乙基丁基亚磺酰基、2-乙基丁基亚磺酰基、1,1,2-三甲基丙基亚磺酰基、1,2,2-三甲基丙基亚磺酰基、1-乙基-1-甲基丙基亚磺酰基或1-乙基-2-甲基丙基亚磺酰基。

[0088] 术语“C₁-C₂ 卤代烷基亚磺酰基为经由亚磺酰基 [S(O)] 连接的如上所定义的 C₁-C₂ 卤代烷基。术语“C₁-C₄ 卤代烷基亚磺酰基”为经由亚磺酰基 [S(O)] 连接的如上所定义的 C₁-C₄ 卤代烷基。术语“C₁-C₆ 卤代烷基亚磺酰基为经由亚磺酰基 [S(O)] 连接的如上所定义的 C₁-C₆ 卤代烷基。C₁-C₂ 卤代烷基亚磺酰基例如为 S(O)CH₂F、S(O)CHF₂、S(O)CF₃、S(O)CH₂Cl、S(O)CHCl₂、S(O)CCl₃、氯氟甲基亚磺酰基、二氯一氟甲基亚磺酰基、一氯二氟甲基亚磺酰基、2-氟乙基亚磺酰基、2-氯乙基亚磺酰基、2-溴乙基亚磺酰基、2-碘乙基亚磺酰基、2,2-二氟乙基亚磺酰基、2,2,2-三氟乙基亚磺酰基、2-氯-2-氟乙基亚磺酰基、2-氯-2,2-二氟乙基亚磺酰基、2,2-二氯-2-氟乙基亚磺酰基、2,2,2-三氯乙基亚磺酰基或 S(O)C₂F₅。C₁-C₄ 卤代烷基亚磺酰基额外例如为 2-氟丙基亚磺酰基、3-氟丙基亚磺酰基、2,2-二氟丙基亚磺酰基、2,3-二氟丙基亚磺酰基、2-氯丙基亚磺酰基、3-氯丙基亚磺酰基、2,3-二氯丙基亚磺酰基、2-溴丙基亚磺酰基、3-溴丙基亚磺酰基、3,3,3-三氟丙基亚磺酰基、3,3,3-三氯丙基亚磺酰基、S(O)CH₂-C₂F₅、S(O)CF₂-C₂F₅、1-(CH₂F)-2-氟乙基亚磺酰基、1-(CH₂Cl)-2-氯乙基亚磺酰基、1-(CH₂Br)-2-溴乙基亚磺酰基、4-氟丁基亚磺酰基、4-氯丁基亚磺酰基、4-溴丁基亚磺酰基或九氟丁基亚磺酰基。C₁-C₆ 卤代烷基亚磺酰基额外例如为 5-氟戊基亚磺酰基、5-氯戊基亚磺酰基、5-溴戊基亚磺酰基、5-碘戊基亚磺酰基、十一氟戊基亚磺酰基、6-氟己基亚磺酰基、6-氯己基亚磺酰基、6-溴己基亚磺酰基、6-碘己基亚磺酰基或十二氟己基亚磺酰基。

[0089] 术语“C₁-C₂ 烷基磺酰基”为经由磺酰基 [S(O)₂] 连接的如上所定义的 C₁-C₂ 烷基。术语“C₁-C₄ 烷基磺酰基”为经由磺酰基 [S(O)₂] 连接的如上所定义的 C₁-C₄ 烷基。术语“C₁-C₆ 烷基磺酰基”为经由磺酰基 [S(O)₂] 连接的如上所定义的 C₁-C₆ 烷基。C₁-C₂ 烷基磺酰基为甲基磺酰基或乙基磺酰基。C₁-C₄ 烷基磺酰基额外例如为正丙基磺酰基、1-甲基乙基磺酰基(异丙基磺酰基)、丁基磺酰基、1-甲基丙基磺酰基(仲丁基磺酰基)、2-甲基丙基磺酰基(异丁基磺酰基)或1,1-二甲基乙基磺酰基(叔丁基磺酰基)。C₁-C₆ 烷基磺酰基额外例如为戊基磺酰基、1-甲基丁基磺酰基、2-甲基丁基磺酰基、3-甲基丁基磺酰基、1,1-二甲基丙基磺酰基、1,2-二甲基丙基磺酰基、2,2-二甲基丙基磺酰基、1-乙基丙基磺酰基、己基磺酰基、1-甲基戊基磺酰基、2-甲基戊基磺酰基、3-甲基戊基磺酰基、4-甲基戊基磺酰基、1,1-二甲基丁基磺酰基、1,2-二甲基丁基磺酰基、1,3-二甲基丁基磺酰基、2,2-二甲基丁基磺酰基、2,3-二甲基丁基磺酰基、3,3-二甲基丁基磺酰基、1-乙基丁基磺酰基、2-乙基丁基磺酰基、1,1,2-三甲基丙基磺酰基、1,2,2-三甲基丙基磺酰基、1-乙基-1-甲基丙基磺酰基或1-乙基-2-甲基丙基磺酰基。

[0090] 术语“ C_1-C_2 卤代烷基磺酰基”为经由磺酰基 $[S(O)_2]$ 连接的如上所定义的 C_1-C_2 卤代烷基。术语“ C_1-C_4 卤代烷基磺酰基”为经由磺酰基 $[S(O)_2]$ 连接的如上所定义的 C_1-C_4 卤代烷基。术语“ C_1-C_6 卤代烷基磺酰基”为经由磺酰基 $[S(O)_2]$ 连接的如上所定义的 C_1-C_6 卤代烷基。 C_1-C_2 卤代烷基磺酰基例如为 $S(O)_2CH_2F$ 、 $S(O)_2CHF_2$ 、 $S(O)_2CF_3$ 、 $S(O)_2CH_2Cl$ 、 $S(O)_2CHCl_2$ 、 $S(O)_2CCl_3$ 、氯氟甲基磺酰基、二氯一氟甲基磺酰基、一氯二氟甲基磺酰基、2-氟乙基磺酰基、2-氯乙基磺酰基、2-溴乙基磺酰基、2-碘乙基磺酰基、2,2-二氟乙基磺酰基、2,2,2-三氟乙基磺酰基、2-氯-2-氟乙基磺酰基、2-氯-2,2-二氟乙基磺酰基、2,2-二氯-2-氟乙基磺酰基、2,2,2-三氯乙基磺酰基或 $S(O)_2C_2F_5$ 。 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基额外例如为 2-氟丙基磺酰基、3-氟丙基磺酰基、2,2-二氟丙基磺酰基、2,3-二氟丙基磺酰基、2-氯丙基磺酰基、3-氯丙基磺酰基、2,3-二氯丙基磺酰基、2-溴丙基磺酰基、3-溴丙基磺酰基、3,3,3-三氟丙基磺酰基、3,3,3-三氯丙基磺酰基、 $S(O)_2CH_2-C_2F_5$ 、 $S(O)_2CF_2-C_2F_5$ 、1-(CH_2F)-2-氟乙基磺酰基、1-(CH_2Cl)-2-氯乙基磺酰基、1-(CH_2Br)-2-溴乙基磺酰基、4-氟丁基磺酰基、4-氯丁基磺酰基、4-溴丁基磺酰基或九氟丁基磺酰基。 C_1-C_6 卤代烷基磺酰基额外例如为 5-氟戊基磺酰基、5-氯戊基磺酰基、5-溴戊基磺酰基、5-碘戊基磺酰基、十一氟戊基磺酰基、6-氟己基磺酰基、6-氯己基磺酰基、6-溴己基磺酰基、6-碘己基磺酰基或十二氟己基磺酰基。

[0091] 术语“杂环基”通常包括 5、6、7 或 8 员的单环杂环基团和 8-10 员双环杂环基团，其中单环和双环基团可以是饱和、部分不饱和或不饱和的。单环和双环杂环基团通常包含 1、2、3 或 4 个选自 N、O 和 S 的杂原子作为环成员。

[0092] 饱和或不饱和 5 或 6 员杂环基团的实例包括饱和或不饱和的非芳族杂环，如吡咯烷基、吡唑啉基、咪唑啉基、吡咯啉基、吡唑啉基、咪唑啉基、四氢呋喃基、二氢呋喃基、1,3-二氧戊环基、二氧杂环戊烯基 (dioxolenyl)、硫杂戊环基 (thiolanyl)、二氢噻吩基、噁唑烷基、异噁唑烷基、噁唑啉基、异噁唑啉基、噻唑啉基、异噻唑啉基、噻唑烷基、异噻唑烷基、氧硫杂戊环基 (oxathiolanyl)、哌啶基、哌嗪基、吡喃基、吡啶烷基、二氢吡喃基、四氢吡喃基、1,3-和 1,4-二噁烷基、噻喃基、二氢噻喃基、四氢噻喃基、吗啉基、噻嗪基等。也包含 1 或 2 个羰基作为环成员的杂环实例包括吡咯烷-2-酮基、吡咯烷-2,5-二酮基、咪唑烷-2-酮基、噁唑烷-2-酮基、噻唑烷-2-酮基等。

[0093] 术语“杂芳基”包括包含 1、2、3 或 4 个选自 N、O 和 S 的杂原子作为环成员的单环 5 或 6 员杂芳族基团。5 或 6 员杂芳族基团的实例包括吡啶基，即 2-、3- 或 4- 吡啶基，嘧啶基，即 2-、4- 或 5- 嘧啶基，吡嗪基，哒嗪基，即 3- 或 4- 哒嗪基，噻吩基，即 2- 或 3- 噻吩基，呋喃基，即 2- 或 3- 呋喃基，吡咯基，即 2- 或 3- 吡咯基，噁唑基，即 2-、3- 或 5- 噁唑基，异噁唑基，即 3-、4- 或 5- 异噁唑基，噻唑基，即 2-、3- 或 5- 噻唑基，异噻唑基，即 3-、4- 或 5- 异噻唑基，吡唑基，即 1-、3-、4- 或 5- 吡唑基，即 1-、2-、4- 或 5- 咪唑基，噁二唑基，例如 2- 或 5-[1,3,4] 噁二唑基，4- 或 5-(1,2,3- 二噁唑) 基，3- 或 5-(1,2,4- 噁二唑) 基，2- 或 5-(1,3,4- 噻二唑) 基，噻二唑基，例如 2- 或 5-(1,3,4- 噻二唑) 基，4- 或 5-(1,2,3- 噻二唑) 基，3- 或 5-(1,2,4- 噻二唑) 基，三唑基，例如 1H-、2H- 或 3H-1,2,3- 三唑-4- 基，2H- 三唑-3- 基，1H-、2H- 或 4H-1,2,4- 三唑基和四唑基，即 1H- 或 2H- 四唑基。

[0094] 术语“杂芳基”也包括包含 1、2 或 3 个选自 N、O 和 S 的杂原子作为环成员的双环 8-10 员杂芳族基团，其中 5 或 6 员杂芳族环与苯基环或与 5 或 6 员杂芳族基团稠合。与苯

基环或与 5 或 6 员杂芳族基团稠合的 5 或 6 员杂芳族环实例包括苯并呋喃基、苯并噻吩基、吲哚基、吲唑基、苯并咪唑基、苯并噁噻唑基 (benzoxathiazolyl)、苯并噁二唑基、苯并噁二唑基、苯并噁嗪基、喹啉基、异喹啉基、嘌呤基、1,8-二氮杂萘基、蝶啶基、吡啶并 [3,2-d] 噻啶基或吡啶并咪唑基等。这些稠合杂芳基可以经由 5 或 6 员杂芳族环的任何环原子或经由稠合苯基结构部分的碳原子与该分子的其余部分键合。

[0095] 术语“苯基烷基”和“苯氧基烷基”分别是指经由烷基,尤其是甲基 (= 杂芳基甲基) 与该分子的其余部分键合的苯基或苯氧基,实例包括苄基、1-苯基乙基、2-苯基乙基、2-苯氧基乙基等。

[0096] 术语“杂环基烷基”和“杂芳基烷基”分别是指经由烷基,尤其是甲基 (分别为杂环基甲基或杂芳基甲基) 与该分子的其余部分键合的如上所定义的杂环基或杂芳基。

[0097] 取代基的下列表述在本文中使用时按如下定义: Me= 甲基, Et= 乙基, Pr= 丙基, i-Pr= 异丙基, Bu= 正丁基, i-Bu= 异丁基, s-Bu= 仲丁基, t-Bu= 叔丁基, c-Pr= 环丙基, Pen= 戊基, c-Pen= 环戊基, c-Hex= 环己基, Ac= 乙酰基, Ph= 苯基。

[0098] 此外以及若存在的话,下述表述例如表示各自的所述含义: 5-CF₃ 为在 5 位的三氟甲基取代基; 3-Cl-5-CF₃ 为在 3 位的氯原子和在 5 位的三氟甲基取代基; 2,6-(Cl)₂ 为在 2 和 6 位的氯原子取代基。

[0099] 下面就式 I 或 II 化合物的各变量 (取代基) 的优选实施方案所作描述单独有效,并且优选相互组合有效。

[0100] 下面就其他变量的优选实施方案所作描述对式 I 或 II 化合物以及本发明的用途和方法及本发明组合物有效。

[0101] 本发明的第一优选实施方案涉及式 I 的哒嗪化合物、其盐及其 N-氧化物以及该类化合物的方法和用途。

[0102] 在式 I 化合物中,优选其中 X¹ 为氧的那些化合物。这些化合物在下文也称为式 II 化合物。

[0103] 在式 I 化合物中,进一步优选其中 R¹ 为氢、CN、C₁-C₁₀ 烷基、C₁-C₁₀ 卤代烷基、C₂-C₁₀ 链烯基、C₂-C₁₀ 卤代链烯基、C₂-C₁₀ 炔基、C₁-C₁₀ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 亚烷基 -CN、OR^a、C(Y)R^b、C(Y)OR^c 或 S(O)₂R^d 的那些化合物。

[0104] 更优选 R¹ 为氢、C₁-C₁₀ 烷基、C₁-C₁₀ 卤代烷基、C₁-C₄ 亚烷基 -CN、杂环基 -C₁-C₅ 烷基、杂芳基 -C₁-C₅ 烷基、C₁-C₅ 亚烷基 -OR^a、C₃-C₁₀ 环烷基 -C₁-C₅ 烷基。最优选 R¹ 为氢、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₃ 亚烷基 -O-C₁-C₃ 烷基。

[0105] 本发明的另一实施方案涉及式 II 的哒嗪化合物、其盐及其 N-氧化物以及该类化合物的方法和用途。在式 II 化合物中,优选其中在式 II 中的 X² 为 OR^{2a} 或 SR^{2a} 的那些化合物。在这些化合物中,R^{2a} 优选为 C₁-C₆ 烷基、C₃-C₆ 链烯基、C₃-C₆ 炔基、C₃-C₆ 环烷基甲基或 C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₁₀ 烷基。

[0106] 本发明的另一实施方案涉及其中 X² 为 NR^{2b}R^{2c} 的式 II 化合物。在这些化合物中,R^{2b} 和 R^{2c} 优选相互独立地选自 C₁-C₆ 烷基、C₃-C₆ 环烷基甲基或 C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₁₀ 烷基或 R^{2b} 和 R^{2c} 与它们所连接的氮原子一起形成饱和的氮键合 5 或 6 员杂环,该杂环可以包含另一选自 O、S 和 N 的杂原子,例如 NR^{2b}R^{2c} 为 1-吡咯烷基、1-哌啶基、1-哌嗪基、4-吗啉基或 4-硫吗啉基。

代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 卤代环烷基和苯基,其中苯基可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的基团。更优选 R^A 选自氢、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基和 C₃-C₆ 卤代环烷基。R^A 尤其选自氢、卤素、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基和 C₃-C₆ 卤代环烷基。R^A 更具体为氢、C₁-C₂ 烷基或 C₁-C₂ 卤代烷基。

[0121] 在其中 A 为 A1 的式 I 和 II 化合物中,进一步优选如下那些化合物,其中 R^N 若存在的话则选自 NO₂、C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 链烯基和 C₂-C₁₀ 炔基,其中后提到的 3 个基团可以未被取代,可以部分或完全被卤代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^x,或者其中 R^N 进一步选自 OR^a、C(Y)R^b、C(Y)OR^c、S(O)_mR^d、NR^eR^f、C(Y)NR^gR^h、S(O)_mNR^eR^f、C(Y)NRⁱNR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -OR^a、C₁-C₅ 亚烷基 -CN、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)R^b、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)OR^c、C₁-C₅ 亚烷基 -NR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)NR^gR^h、C₁-C₅ 亚烷基 -S(O)_mR^d、C₁-C₅ 亚烷基 -S(O)_mNR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -NRⁱNR^eR^f、杂环基、杂芳基、C₃-C₁₀ 环烷基、C₅-C₁₀ 环烯基、杂环基 -C₁-C₅ 烷基、杂芳基 -C₁-C₅ 烷基、C₃-C₁₀ 环烷基 -C₁-C₅ 烷基、C₅-C₁₀ 环烯基 -C₁-C₅ 烷基、苯基 -C₁-C₅ 烷基和苯基,其中后提到的 10 个基团的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^y。

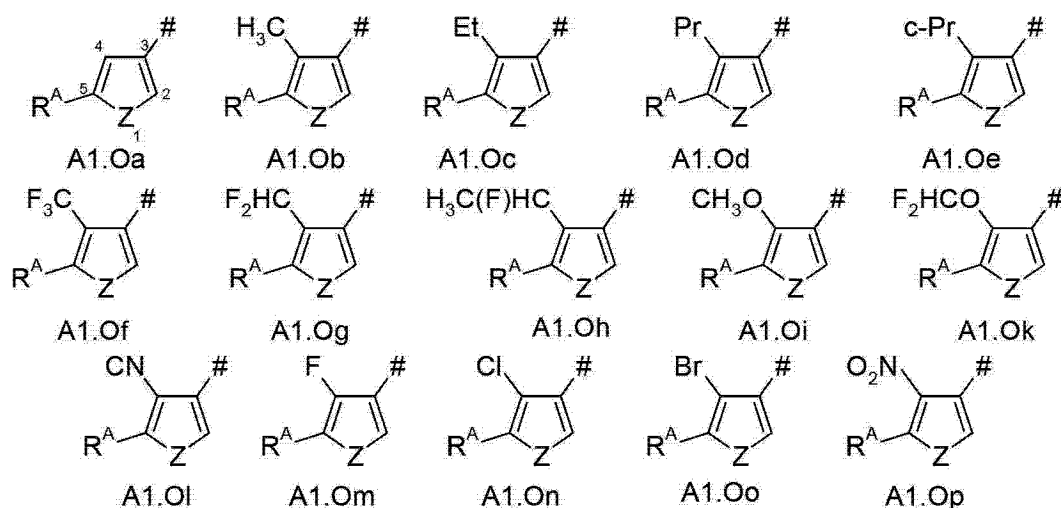
[0122] 优选其中 A 为 A1 的化合物中,R^N 若存在的话则优选选自 C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 链烯基和 C₂-C₁₀ 炔基,其中后提到的 3 个基团可以未被取代,可以部分或完全被卤代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^x,或者其中 R^N 进一步选自杂环基、杂芳基、C₃-C₁₀ 环烷基、C₅-C₁₀ 环烯基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₂-C₄ 烷基、杂环基 -C₁-C₅ 烷基、杂芳基 -C₁-C₅ 烷基、C₃-C₁₀ 环烷基 -C₁-C₅ 烷基、C₅-C₁₀ 环烯基 -C₁-C₅ 烷基。

[0123] 优选其中 A 为 A1 的化合物中,R^N 优选选自 C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基 -C₁-C₄ 烷基、杂环基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、CN-C₁-C₄ 烷基。

[0124] R^N 若存在的话则尤其为 C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₂-C₄ 烷基。更优选 R^N 若存在的话则为 C₁-C₄ 烷基或 C₁-C₄ 卤代烷基。

[0125] 合适基团 A1 的实例是式 A1.0a、A1.0b、A1.0c、A1.0d、A1.0e、A1.0f、A1.0g、A1.0h、A1.0i、A1.0k、A1.0l、A1.0m、A1.0n、A1.0o 和 A1.0p 的基团,其中 Z 为 O 且 R^A 为在表 A 的一行中所定义的基团(类型 A1.Zxy 的基团,其中 x 表示下文在各式的编号中所代表的字母 a-p,而 y 表示表 A 的 1-15 行中的各行)。其中 Z 为 O 的合适基团编号为 A1.0a1-A1.0a15 至 A1.0p 1-A1.0p 15:

[0126]

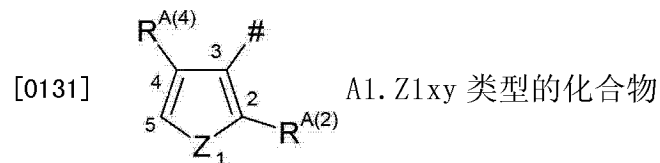


[0127] 取代基在基团 A1.0a 中的碳原子上的不同位置 (2、3、4 和 5) 定义在本发明所有基团 A1 中完全相同: Z 总是具有编号为 1 的位置且与该化合物的酰胺部分的连接具有编号为 3 的位置。

[0128] 表 A:

序号	R ^A	序号	R ^A	序号	R ^A
1	H	6	CF ₃	11	CN
2	CH ₃	7	CHF ₂	12	F
3	CH ₂ CH ₃	8	CH(F)CH ₃	13	Cl
4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	9	OCH ₃	14	Br
5	c-Pr	11	OCHF ₂	15	NO ₂

[0130] 类似于上述基团 A1.0a1-A1.0a15 至 A1.0p1-A1.0p15 的是式 A1.01a、A1.01b、A1.01c、A1.01d、A1.01e、A1.01f、A1.01g、A1.01h、A1.01i、A1.01k、A1.01l、A1.01m、A1.01n、A1.01o 和 A1.01p 的基团 A1, 其中 R^A 不是位于基团 A1.0a 的结构中所示的 5 位, 而是位于 2 位, 此时 5 位为 H 且其余基团如上所定义, 即在 4 和 2 位的 R^A 相互独立地具有表 A 各行的含义。该基团编号为 A1.01a1-A1.01a15 至 A1.01p1-A1.01p15 并且具有如下结构, 其中 2 和 4 位的取代基的含义如表 R^A 所示:



[0132] 表 R^A:

[0133]

序号	R ^{Λ(2)}	R ^{Λ(4)}
A1.O1a-1	H	H
A1.O1a-2	CH ₃	H
A1.O1a-3	CH ₂ CH ₃	H
A1.O1a-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A1.O1a-5	c-Pr	H
A1.O1a-6	CF ₃	H
A1.O1a-7	CHF ₂	H
A1.O1a-8	CHFCH ₃	H
A1.O1a-9	OCH ₃	H
A1.O1a-10	OCHF ₂	H
A1.O1a-11	CN	H
A1.O1a-12	F	H
A1.O1a-13	Cl	H
A1.O1a-14	Br	H
A1.O1a-15	NO ₂	H
A1.O1b-1	H	CH ₃
A1.O1b-2	CH ₃	CH ₃
A1.O1b-3	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A1.O1b-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A1.O1b-5	c-Pr	CH ₃
A1.O1b-6	CF ₃	CH ₃
A1.O1b-7	CHF ₂	CH ₃
A1.O1b-8	CHFCH ₃	CH ₃
A1.O1b-9	OCH ₃	CH ₃
A1.O1b-10	OCHF ₂	CH ₃
A1.O1b-11	CN	CH ₃
A1.O1b-12	F	CH ₃
A1.O1b-13	Cl	CH ₃
A1.O1b-14	Br	CH ₃
A1.O1b-15	NO ₂	CH ₃
A1.O1c-1	H	CH ₂ CH ₃
A1.O1c-2	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A1.O1c-3	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A1.O1c-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A1.O1c-5	c-Pr	CH ₂ CH ₃
A1.O1c-6	CF ₃	CH ₂ CH ₃
A1.O1c-7	CHF ₂	CH ₂ CH ₃
A1.O1c-8	CHFCH ₃	CH ₂ CH ₃
A1.O1c-9	OCH ₃	CH ₂ CH ₃
A1.O1c-10	OCHF ₂	CH ₂ CH ₃
A1.O1c-11	CN	CH ₂ CH ₃

序号	R ^{Λ(2)}	R ^{Λ(4)}
A1.O1c-12	F	CH ₂ CH ₃
A1.O1c-13	Cl	CH ₂ CH ₃
A1.O1c-14	Br	CH ₂ CH ₃
A1.O1c-15	NO ₂	CH ₂ CH ₃
A1.O1d-1	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A1.O1d-2	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A1.O1d-3	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A1.O1d-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A1.O1d-5	c-Pr	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A1.O1d-6	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A1.O1d-7	CHF ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A1.O1d-8	CHFCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A1.O1d-9	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A1.O1d-10	OCHF ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A1.O1d-11	CN	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A1.O1d-12	F	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A1.O1d-13	Cl	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A1.O1d-14	Br	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A1.O1d-15	NO ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A1.O1e-1	H	c-Pr
A1.O1e-2	CH ₃	c-Pr
A1.O1e-3	CH ₂ CH ₃	c-Pr
A1.O1e-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	c-Pr
A1.O1e-5	c-Pr	c-Pr
A1.O1e-6	CF ₃	c-Pr
A1.O1e-7	CHF ₂	c-Pr
A1.O1e-8	CHFCH ₃	c-Pr
A1.O1e-9	OCH ₃	c-Pr
A1.O1e-10	OCHF ₂	c-Pr
A1.O1e-11	CN	c-Pr
A1.O1e-12	F	c-Pr
A1.O1e-13	Cl	c-Pr
A1.O1e-14	Br	c-Pr
A1.O1e-15	NO ₂	c-Pr
A1.O1f-1	H	CF ₃
A1.O1f-2	CH ₃	CF ₃
A1.O1f-3	CH ₂ CH ₃	CF ₃
A1.O1f-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃
A1.O1f-5	c-Pr	CF ₃
A1.O1f-6	CF ₃	CF ₃
A1.O1f-7	CHF ₂	CF ₃

[0134]

序号	R ^{A(2)}	R ^{A(4)}
A1.O1f-8	CHFCH ₃	CF ₃
A1.O1f-9	OCH ₃	CF ₃
A1.O1f-10	OCHF ₂	CF ₃
A1.O1f-11	CN	CF ₃
A1.O1f-12	F	CF ₃
A1.O1f-13	Cl	CF ₃
A1.O1f-14	Br	CF ₃
A1.O1f-15	NO ₂	CF ₃
A1.O1g-1	H	CHF ₂
A1.O1g-2	CH ₃	CHF ₂
A1.O1g-3	CH ₂ CH ₃	CHF ₂
A1.O1g-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CHF ₂
A1.O1g-5	c-Pr	CHF ₂
A1.O1g-6	CF ₃	CHF ₂
A1.O1g-7	CHF ₂	CHF ₂
A1.O1g-8	CHFCH ₃	CHF ₂
A1.O1g-9	OCH ₃	CHF ₂
A1.O1g-10	OCHF ₂	CHF ₂
A1.O1g-11	CN	CHF ₂
A1.O1g-12	F	CHF ₂
A1.O1g-13	Cl	CHF ₂
A1.O1g-14	Br	CHF ₂
A1.O1g-15	NO ₂	CHF ₂
A1.O1h-1	H	CHFCH ₃
A1.O1h-2	CH ₃	CHFCH ₃
A1.O1h-3	CH ₂ CH ₃	CHFCH ₃
A1.O1h-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CHFCH ₃
A1.O1h-5	c-Pr	CHFCH ₃
A1.O1h-6	CF ₃	CHFCH ₃
A1.O1h-7	CHF ₂	CHFCH ₃
A1.O1h-8	CHFCH ₃	CHFCH ₃
A1.O1h-9	OCH ₃	CHFCH ₃
A1.O1h-10	OCHF ₂	CHFCH ₃
A1.O1h-11	CN	CHFCH ₃
A1.O1h-12	F	CHFCH ₃
A1.O1h-13	Cl	CHFCH ₃
A1.O1h-14	Br	CHFCH ₃
A1.O1h-15	NO ₂	CHFCH ₃
A1.O1i-1	H	OCH ₃
A1.O1i-2	CH ₃	OCH ₃
A1.O1i-3	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
A1.O1i-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	OCH ₃
A1.O1i-5	c-Pr	OCH ₃
A1.O1i-6	CF ₃	OCH ₃
A1.O1i-7	CHF ₂	OCH ₃
A1.O1i-8	CHFCH ₃	OCH ₃
A1.O1i-9	OCH ₃	OCH ₃

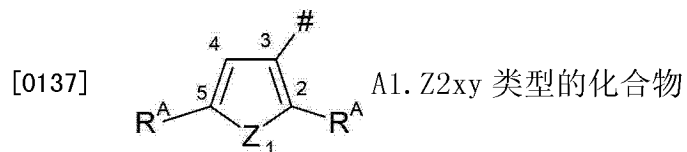
序号	R ^{A(2)}	R ^{A(4)}
A1.O1i-10	OCHF ₂	OCH ₃
A1.O1i-11	CN	OCH ₃
A1.O1i-12	F	OCH ₃
A1.O1i-13	Cl	OCH ₃
A1.O1i-14	Br	OCH ₃
A1.O1i-15	NO ₂	OCH ₃
A1.O1k-1	H	OCHF ₂
A1.O1k-2	CH ₃	OCHF ₂
A1.O1k-3	CH ₂ CH ₃	OCHF ₂
A1.O1k-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	OCHF ₂
A1.O1k-5	c-Pr	OCHF ₂
A1.O1k-6	CF ₃	OCHF ₂
A1.O1k-7	CHF ₂	OCHF ₂
A1.O1k-8	CHFCH ₃	OCHF ₂
A1.O1k-9	OCH ₃	OCHF ₂
A1.O1k-10	OCHF ₂	OCHF ₂
A1.O1k-11	CN	OCHF ₂
A1.O1k-12	F	OCHF ₂
A1.O1k-13	Cl	OCHF ₂
A1.O1k-14	Br	OCHF ₂
A1.O1k-15	NO ₂	OCHF ₂
A1.O1l-1	H	CN
A1.O1l-2	CH ₃	CN
A1.O1l-3	CH ₂ CH ₃	CN
A1.O1l-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CN
A1.O1l-5	c-Pr	CN
A1.O1l-6	CF ₃	CN
A1.O1l-7	CHF ₂	CN
A1.O1l-8	CHFCH ₃	CN
A1.O1l-9	OCH ₃	CN
A1.O1l-10	OCHF ₂	CN
A1.O1l-11	CN	CN
A1.O1l-12	F	CN
A1.O1l-13	Cl	CN
A1.O1l-14	Br	CN
A1.O1l-15	NO ₂	CN
A1.O1m-1	H	F
A1.O1m-2	CH ₃	F
A1.O1m-3	CH ₂ CH ₃	F
A1.O1m-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	F
A1.O1m-5	c-Pr	F
A1.O1m-6	CF ₃	F
A1.O1m-7	CHF ₂	F
A1.O1m-8	CHFCH ₃	F
A1.O1m-9	OCH ₃	F
A1.O1m-10	OCHF ₂	F
A1.O1m-11	CN	F

[0135]

序号	R ^{A(2)}	R ^{A(4)}
A1.O1m-12	F	F
A1.O1m-13	Cl	F
A1.O1m-14	Br	F
A1.O1m-15	NO ₂	F
A1.O1n-1	H	Cl
A1.O1n-2	CH ₃	Cl
A1.O1n-3	CH ₂ CH ₃	Cl
A1.O1n-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl
A1.O1n-5	c-Pr	Cl
A1.O1n-6	CF ₃	Cl
A1.O1n-7	CHF ₂	Cl
A1.O1n-8	CHFCH ₃	Cl
A1.O1n-9	OCH ₃	Cl
A1.O1n-10	OCHF ₂	Cl
A1.O1n-11	CN	Cl
A1.O1n-12	F	Cl
A1.O1n-13	Cl	Cl
A1.O1n-14	Br	Cl
A1.O1n-15	NO ₂	Cl
A1.O1o-1	H	Br
A1.O1o-2	CH ₃	Br
A1.O1o-3	CH ₂ CH ₃	Br
A1.O1o-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Br
A1.O1o-5	c-Pr	Br
A1.O1o-6	CF ₃	Br

序号	R ^{A(2)}	R ^{A(4)}
A1.O1o-7	CHF ₂	Br
A1.O1o-8	CHFCH ₃	Br
A1.O1o-9	OCH ₃	Br
A1.O1o-10	OCHF ₂	Br
A1.O1o-11	CN	Br
A1.O1o-12	F	Br
A1.O1o-13	Cl	Br
A1.O1o-14	Br	Br
A1.O1o-15	NO ₂	Br
A1.O1p-1	H	NO ₂
A1.O1p-2	CH ₃	NO ₂
A1.O1p-3	CH ₂ CH ₃	NO ₂
A1.O1p-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	NO ₂
A1.O1p-5	c-Pr	NO ₂
A1.O1p-6	CF ₃	NO ₂
A1.O1p-7	CHF ₂	NO ₂
A1.O1p-8	CHFCH ₃	NO ₂
A1.O1p-9	OCH ₃	NO ₂
A1.O1p-10	OCHF ₂	NO ₂
A1.O1p-11	CN	NO ₂
A1.O1p-12	F	NO ₂
A1.O1p-13	Cl	NO ₂
A1.O1p-14	Br	NO ₂
A1.O1p-15	NO ₂	NO ₂

[0136] 类似于上述基团 A1.0a1-A1.0a15 至 A1.0p1-A1.0p15 的是式 A1.02a、A1.02b、A1.02c、A1.02d、A1.02e、A1.02f、A1.02g、A1.02h、A1.02i、A1.02k、A1.02l、A1.02m、A1.02n、A1.02o 和 A1.02p 的基团 A1, 其中在该基团的 2 位取代基不为 H 而是具有表 A 各行的含义, 4 位取代基总是为 H 且 3 和 5 位的其他剩余基团如上所定义, 即 2 和 5 位的 R^A 相互独立地具有表 A 各行的含义。该基团编号为 A1.02a1-A1.02a15 至 A1.02p1-A1.02p15 并且具有如下结构, 其中 2 和 5 位的取代基的含义如上表 R^A 的各行所示:



[0138] 类似于上面所列结构 A1.0a 至 A1.0p, 合适基团 A1 的实例是式 A1.Sa、A1.Sb、A1.Sc、A1.Sd、A1.Se、A1.Sf、A1.Sg、A1.Sh、A1.Si、A1.Sk、A1.Sl、A1.Sm、A1.Sn、A1.So 和 A1.Sp 的基团, 其结构对应于上面的结构 A1.0a1 至 A1.0p15, 其中 Z 为 S 而不是 O 且 R^A 为如上表 A 的一行所定义的基团 (基团 A1.Sa1-A1.Sa15 至 A1.Sp1-A1.Sp15)。

[0139] 类似于上面所列结构 A1.01a 至 A1.01p, 合适基团 A1 的实例是式 A1.S1a、A1.S1b、A1.S1c、A1.S1d、A1.S1e、A1.S1f、A1.S1g、A1.S1h、A1.S1i、A1.S1k、A1.S1l、A1.S1m、A1.S1n、A1.S1o 和 A1.S1p 的基团, 其对应于上面的结构 A1.01a 至 A1.01p, 其中 Z 为 S 而不是 O 且 R^A 为如上表 A 的一行所定义的基团 (基团 A1.S1a1-A1.S1a15 至 A1.S1p1-A1.S1p15)。

[0140] 类似于上述基团 A1.02a 至 A1.02p 的是式 A1.S2a、A1.S2b、A1.S2c、A1.S2d、

A1. S2e、A1. S2f、A1. S2g、A1. S2h、A1. S2i、A1. S2k、A1. S2l、A1. S2m、A1. S2n、A1. S2o 和 A1. S2p 的基团 A1, 其对应于上面的结构 A1. 02a 至 A1. 02p, 其中 Z 为 S 而不是 O 且其余基团相同。该类基团编号为 A1. S2a1-A1. S2a15 至 A1. S2p1-A1. S2p15。

[0141] 类似于上面所列结构 A1. 0a 至 A1. 0p, 合适基团 A1 的实例是式 A1. Na、A1. Nb、A1. Nc、A1. Nd、A1. Ne、A1. Nf、A1. Ng、A1. Nh、A1. Ni、A1. Nk、A1. Nl、A1. Nm、A1. Nn、A1. No 和 A1. Np 的基团, 其对应于上面的结构 A1. 0a1 至 A1. 0p15, 其中 Z 为 NH 而不是 O 且 R^A 为如上表 A 的一行所定义的基团 (基团 A1. Na1-A1. Na15 至 A1. Np1-A1. Np15)。

[0142] 类似于上面所列结构 A1. 01a 至 A1. 01p, 合适基团 A1 的实例是式 A1. N1a、A1. N1b、A1. N1c、A1. N1d、A1. N1e、A1. N1f、A1. N1g、A1. N1h、A1. N1i、A1. N1k、A1. N1l、A1. N1m、A1. N1n、A1. N1o 和 A1. N1p 的基团, 其结构对应于上面的结构 A1. 01a 至 A1. 01p, 其中 Z 为 NH 而不是 O 且 R^A 为如上表 A 的一行所定义的基团 (基团 A1. N1a1-A1. N1a15 至 A1. N1o1-A1. N1o15)。

[0143] 类似于上述基团 A1. 02a 至 A1. 02p 的是式 A1. N2a、A1. N2b、A1. N2c、A1. N2d、A1. N2e、A1. N2f、A1. N2g、A1. N2h、A1. N2i、A1. N2k、A1. N2l、A1. N2m、A1. N2n、A1. N2o 和 A1. N2p 的基团 A1, 其结构对应于上面的结构 A1. 02a 至 A1. 02p, 其中 Z 为 NH 而不是 O 且剩余基团相同。该类基团编号为 A1. N2a1-A1. N2a15 至 A1. N2p1-A1. N2p15。

[0144] 类似于其中 Z 为 NH ($R^N=H$) 的基团 A1 (即 A1. Na1-A1. Na15 至 A1. Np1-A1. Np15 和 A1. N1a1-A1. N1a15 至 A1. N1p1-A1. N1p15 和 A1. N2a1-A1. N2a15 至 A1. N2p1-A1. N2p15 类型的基团) 的上述结构的是编号为 A1. 1Na1-A1. 84Na15 至 A1. 1Np1-A1. 84Np15 和 A1. 1N1a1-A1. 84N1a15 至 A1. 1N1p1-A1. 84N1p15 和 A1. 1N2a1-A1. 84N2a15 至 A1. 1N2p1-A1. 84N2p15 的基团, 其中 Z 为 NR^N , 其中 R^N 具有下表 N 中各行的含义:

[0145]

表 N:

序号	R ^N
N-1	CH ₃
N-2	CH ₂ OCH ₃
N-3	CH ₂ OCF ₃
N-4	CH ₂ OCHF ₂
N-5	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
N-6	CH ₂ CH ₃
N-7	CH ₂ CH ₂ CH ₃
N-8	CH(CH ₂ CH ₂)
N-9	CH(CH ₂ CCl ₂)
N-10	CH(CH ₂ CMe ₂)
N-11	CH(CH ₃) ₂
N-12	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₂)
N-13	CH ₂ CH(CH ₂ CCl ₂)
N-14	CH ₂ CH(CH ₂ CMe ₂)
N-15	CH ₂ CF ₃
N-16	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
N-17	C(CH ₃) ₃
N-18	C ₆ H ₅
N-19	4-Cl-C ₆ H ₄
N-20	4-F-C ₆ H ₄
N-21	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
N-22	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄
N-23	2-吡啶基
N-24	5-氯-2-吡啶基
N-25	CH ₂ -C ₆ H ₅
N-26	4-(F ₃ CO)-C ₆ H ₄
N-27	4-(F ₃ CS)-C ₆ H ₄

序号	R ^N
N-28	4-(F ₂ HCO)-C ₆ H ₄
N-29	4-((F ₃ C) ₂ FC)-C ₆ H ₄
N-30	4-(SO ₂ CH ₃)-C ₆ H ₄
N-31	2,6-Cl-4-CF ₃ -C ₆ H ₂
N-32	3-Cl-5-CF ₃ -吡啶-2-基
N-33	3-吡啶基
N-34	4-吡啶基
N-35	4-NO ₂ -C ₆ H ₄
N-36	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
N-37	2,4-F ₂ -C ₆ H ₃
N-38	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
N-39	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
N-40	4-C(CH ₃) ₃ -C ₆ H ₄
N-41	3-Cl-C ₆ H ₄
N-42	3-F-C ₆ H ₄
N-43	2-F-C ₆ H ₄
N-44	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
N-45	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
N-46	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
N-47	3-Cl-4-F-C ₆ H ₃
N-48	3-NO ₂ -C ₆ H ₄
N-49	2-CH ₃ -C ₆ H ₄
N-50	3-CH ₃ -C ₆ H ₄
N-51	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
N-52	2-F-4-Cl-C ₆ H ₃
N-53	2,4,6-Cl ₃ -C ₆ H ₂
N-54	2,3,4-Cl ₃ -C ₆ H ₂
N-55	2,6-F ₂ -C ₆ H ₃

[0146]

序号	R ^N
N-56	CH ₂ F
N-57	CHF ₂
N-58	CF ₃
N-59	CH ₂ CHF ₂
N-60	CH ₂ Cl
N-61	CHCl ₂
N-62	CCl ₃
N-63	CH ₂ CHCl ₂
N-64	CH ₂ CCl ₃
N-65	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
N-66	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
N-67	CH ₂ CH ₂ OCF ₃
N-68	CH ₂ CH ₂ OCHF ₂
N-69	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
N-70	2-NO ₂ -C ₆ H ₄

序号	R ^N
N-71	6-氯-2-吡啶基
N-72	5-硝基-2-吡啶基
N-73	3-硝基-2-吡啶基
N-74	6-甲基-5-硝基-2-吡啶基
N-75	乙烯基
N-76	2-丙烯基
N-77	四氢呋喃-2-基
N-78	四氢呋喃-3-基
N-79	[1,3]二氧戊环-2-基
N-80	[1,3]二氧戊环-4-基
N-81	四氢呋喃-2-基甲基
N-82	四氢呋喃-3-基甲基
N-83	[1,3]二氧戊环-2-基甲基
N-84	[1,3]二氧戊环-4-基甲基

[0147] A1. Za1、A1. Z1a1 和 A1. Z2a1 类型的基团表示其中 2、3 和 5 位取代基为氢的相同结构。

[0148] 本发明的另一实施方案涉及其中 A 为基团 A2 的式 I 和 II 的哒嗪化合物、其盐及其 N-氧化物以及该类化合物的方法和用途。

[0149] 在其中 A 为基团 A2 的式 I 和 II 化合物中, 优选其中 X¹、R¹、R^t、R^u、R^v 和 R^w 如上所定义并且尤其具有优选含义之一的式 I 或 II 化合物。

[0150] 在其中 A 为 A2 的化合物中, 优选其中 X¹、R¹、R^t、R^u、R^v 和 R^w 如上所定义并且尤其具有优选含义之一以及其中 n 为 1 的式 I 化合物。

[0151] 在其中 A 为 A2 的化合物中, 优选其中 X¹、R¹、R^t、R^u、R^v 和 R^w 如上所定义并且尤其具有优选含义之一以及其中 n 为 2 的式 I 化合物。

[0152] 在其中 A 为 A2 的式 I 和 II 化合物中, 优选如下那些化合物, 其中 R^A 选自氢、卤素、CN、C₁-C₄ 烷基和 C₂-C₁₀ 链烯基, 其中后提到的 2 个基团可以未被取代, 可以部分或完全被卤代或者可以带有 1、2 或 3 个选自 C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₃-C₆ 环烷基、杂芳基、苯基和苯氧基的相同或不同取代基, 其中后提到的 3 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基磺酰基和 C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基的基团, 或者其中 R^A 进一步选自 C₃-C₆ 环烷基、C₅-C₆ 杂芳基和苯基, 其中后提到的 3 个基团可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 卤代烷氧基、C₁-C₄ 烷基磺酰基和 C₁-C₄ 卤代烷基磺酰基的相同或不同取代基。

[0153] 优选在其中 A 为 A2 的化合物中 R^A 优选选自氢、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 卤代环烷基和苯基, 其中苯基可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个选自卤素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基和 C₁-C₄ 卤代烷氧基的基团。更优选 R^A 选自氢、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基和 C₃-C₆ 卤代环烷

基。R^A 尤其选自氢、卤素、NO₂、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基和 C₃-C₆ 卤代环烷基。R^A 更具体为氢、C₁-C₂ 烷基或 C₁-C₂ 卤代烷基。

[0154] 在其中 A 为 A2 的式 I 和 II 化合物中, 进一步优选如下那些化合物, 其中 R^N 若存在的话则选自 NO₂、C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 链烯基和 C₂-C₁₀ 炔基, 其中后提到的 3 个基团可以未被取代, 可以部分或完全被卤代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^X, 或者其中 R^N 进一步选自 OR^a、C(Y)R^b、C(Y)OR^c、S(O)_mR^d、NR^eR^f、C(Y)NR^gR^h、S(O)_mNR^eR^f、C(Y)NRⁱNR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -OR^a、C₁-C₅ 亚烷基 -CN、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)R^b、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)OR^c、C₁-C₅ 亚烷基 -NR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -C(Y)NR^gR^h、C₁-C₅ 亚烷基 -S(O)_mR^d、C₁-C₅ 亚烷基 -S(O)_mNR^eR^f、C₁-C₅ 亚烷基 -NRⁱNR^eR^f、杂环基、杂芳基、C₃-C₁₀ 环烷基、C₅-C₁₀ 环烯基、杂环基 -C₁-C₅ 烷基、杂芳基 -C₁-C₅ 烷基、C₃-C₁₀ 环烷基 -C₁-C₅ 烷基、C₅-C₁₀ 环烯基 -C₁-C₅ 烷基、苯基 -C₁-C₅ 烷基和苯基, 其中后提到的 10 个基团的环可以未被取代或者可以带有 1、2、3、4 或 5 个相同或不同的取代基 R^V。

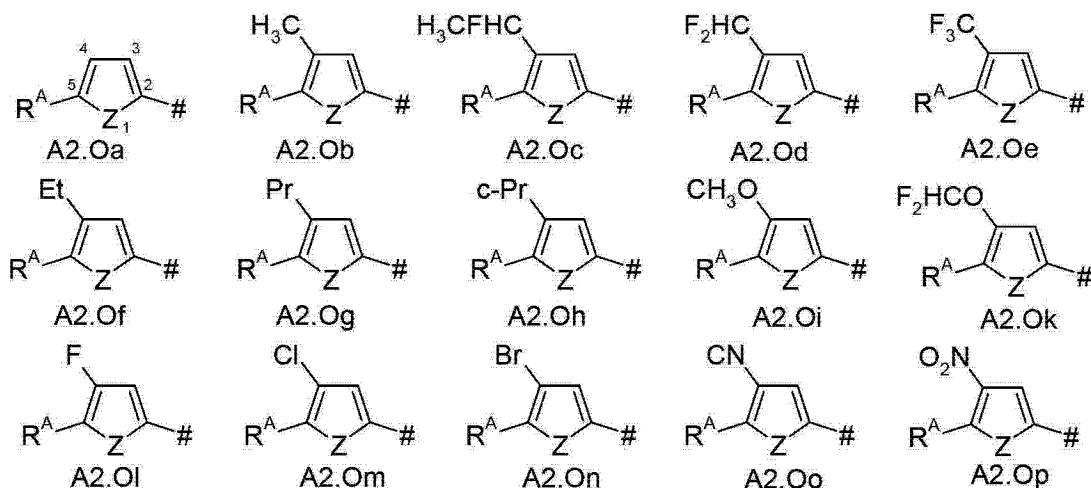
[0155] 优选在其中 A 为 A2 的化合物中 R^N 若存在的话则优选选自 C₁-C₁₀ 烷基、C₂-C₁₀ 链烯基和 C₂-C₁₀ 炔基, 其中后提到的 3 个基团可以未被取代, 可以部分或完全被卤代或者可以带有 1、2 或 3 个相同或不同的取代基 R^X, 或者其中 R^N 进一步选自杂环基、杂芳基、C₃-C₁₀ 环烷基、C₅-C₁₀ 环烯基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₂-C₄ 烷基、杂环基 -C₁-C₅ 烷基、杂芳基 -C₁-C₅ 烷基、C₃-C₁₀ 环烷基 -C₁-C₅ 烷基、C₅-C₁₀ 环烯基 -C₁-C₅ 烷基。

[0156] 优选在其中 A 为 A2 的化合物中 R^N 优选选自 C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基 -C₁-C₄ 烷基、杂环基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₁-C₄ 烷基、CN-C₁-C₄ 烷基。

[0157] R^N 若存在的话则尤其为 C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基 -C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烷氧基 -C₂-C₄ 烷基。更优选 R^N 若存在的话则为 C₁-C₄ 烷基或 C₁-C₄ 卤代烷基。

[0158] 合适基团 A2 的实例是式 A2. 0a、A2. 0b、A2. 0c、A2. 0d、A2. 0e、A2. 0f、A2. 0g、A2. 0h、A2. 0i、A2. 0k、A2. 0l、A2. 0m、A2. 0n、A2. 0o 和 A2. 0p 的基团, 其中 Z 为 O 且 R^A 为如表 A 的一行中所定义的基团 (基团 A2. 0a1-A2. 0a15 至 A2. 0o1-A2. 0p15) :

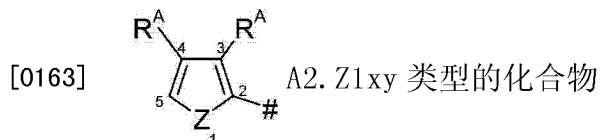
[0159]



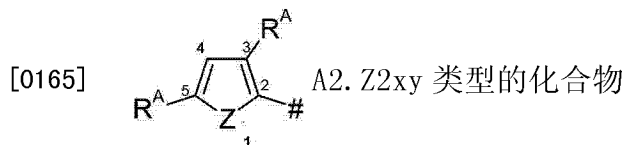
[0160] A2. Z_x 类型的化合物

[0161] 取代基在基团 A2. 0a 中的碳原子上的不同位置 (2、3、4 和 5) 定义在本发明所有基团 A2 中完全相同: Z 总是具有编号为 1 的位置且与该化合物的酰胺部分的连接具有编号为 2 的位置。

[0162] 类似于上述基团 A2.0a1-A2.0a15 至 A2.0p1-A2.0p15 的是式 A2.01a、A2.01b、A2.01c、A2.01d、A2.01e、A2.01f、A2.01g、A2.01h、A2.01i、A2.01k、A2.01l、A2.01m、A2.01n、A2.01o 和 A2.01p 的基团 A2, 其中 R^A 不是位于基团 A2.0a 的结构中所示的 5 位而是位于 3 位, 5 位现在为 H 且剩余基团如上所定义, 即 R^A 为上表 A 的一行中所定义的基团。该类基团编号为 A2.01a1-A2.01a15 至 A2.01p1-A2.01p15 且具有如下结构:



[0164] 类似于上述基团 A2.0a1-A2.0a15 至 A2.0p1-A2.0p15 的是式 A2.02a、A2.02b、A2.02c、A2.02d、A2.02e、A2.02f、A2.02g、A2.02h、A2.02i、A2.02k、A2.02l、A2.02m、A2.02n、A2.02o 和 A2.02p 的基团 A2, 其中该基团 3 位的取代基为表 A 的各行而不是 H, 4 位的基团总是为 H 且其他剩余基团如上所定义, 即 5 位的 R^A 是表 A 的一行中所定义的基团。该类基团编号为 A2.02a1-A2.02a15 至 A2.02p1-A2.02p15 且具有如下结构:



[0166] 类似于上面所列结构 A2.0a 至 A2.0p, 合适基团 A2 的实例是式 A2.Sa、A2.Sb、A2.Sc、A2.Sd、A2.Se、A2.Sf、A2.Sg、A2.Sh、A2.Si、A2.Sk、A2.Sl、A2.Sm、A2.Sn、A2.So 和 A2.Sp 的基团, 其对应于上面的结构 A2.0a1-A2.0o15, 其中 Z 为 S 而不是 O 且 R^A 为如上表 A 的一行所定义的基团 (基团 A2.Sa1-A2.Sa15 至 A2.So1-A2.So15)。

[0167] 类似于上面所列结构 A2.01a 至 A2.01p, 合适基团 A2 的实例是式 A2.S1a、A2.S1b、A2.S1c、A2.S1d、A2.S1e、A2.S1f、A2.S1g、A2.S1h、A2.S1i、A2.S1k、A2.S1l、A2.S1m、A2.S1n、A2.S1o 和 A2.Sp 的基团, 其对应于上面的结构 A2.01a 至 A2.01o, 其中 Z 为 S 而不是 O 且 R^A 为如上表 A 的一行所定义的基团 (基团 A2.S1a1-A2.S1a15 至 A2.S1p1-A2.S1p15)。

[0168] 类似于上述基团 A2.02a1-A2.02a15 至 A2.02p1-A2.02p15 的是式 A2.S2a、A2.S2b、A2.S2c、A2.S2d、A2.S2e、A2.S2f、A2.S2g、A2.S2h、A2.S2i、A2.S2k、A2.S2l、A2.S2m、A2.S2n、A2.S2o 和 A2.S2p 的基团 A2, 其对应于上面的结构 A2.02a 至 A2.02p, 其中 Z 为 S 而不是 O 且剩余基团相同。该类基团编号为 A2.S2a1-A2.S2a15 至 A2.S2p1-A2.S2p15。

[0169] 类似于上面所列结构 A2.0a 至 A2.0p, 合适基团 A2 的实例是式 A2.Na、A2.Nb、A2.Nc、A2.Nd、A2.Ne、A2.Nf、A2.Ng、A2.Nh、A2.Ni、A2.Nk、A2.Nl、A2.Nm、A2.Nn、A2.No 和 A2.Np 的基团, 其对应于上面的结构 A2.0a1-A2.0p15, 其中 Z 为 NH 而不是 O 且 R^A 为如上表 A 的一行所定义的基团 (基团 A2.Na1-A2.Na15 至 A2.Np1-A2.Np15)。

[0170] 类似于上述结构 A2.01a1-A2.01a15 至 A2.01p1-A2.01p15, 合适基团 A2 的实例是式 A2.N1a、A2.N1b、A2.N1c、A2.N1d、A2.N1e、A2.N1f、A2.N1g、A2.N1h、A2.N1i、A2.N1k、A2.N1l、A2.N1m、A2.N1n、A2.N1o 和 A2 的基团, 其对应于上面的结构 A2.01a 至 A2.01o, 其中 Z 为 NH 而不是 O 且 R^A 为如上表 A 的一行所定义的基团 (基团 A2.N1a1-A2.N1a15 至 A2.N1o1-A2.N1o15)。

[0171] 类似于上述基团 A2.02a1-A2.02a15 至 A2.02p1-A2.02p15 的是式 A2.N2a、A2.N2b、A2.N2c、A2.N2d、A2.N2e、A2.N2f、A2.N2g、A2.N2h、A2.N2i、A2.N2k、A2.N2l、A2.N2m、A2.N2n、

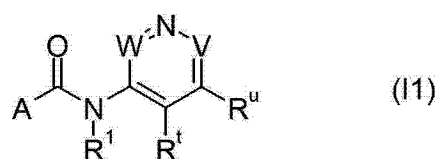
A2. N2o 和 A2. N2p 的基团 A1, 其对应于上面的结构 A2. 02a 至 A2. 02p, 其中 Z 为 NH 而不是 O 且剩余基团相同。该类基团编号为 A2. N2a1-A2. N2a15 至 A2. N2p1-A2. N2p15。

[0172] 类似于其中 Z 为 NH 的基团 A2 ($R^N=H$, 即 A2. Na1-A2. Na15 至 A2. Np1-A2. Np15 和 A2. N1a1-A2. N1a15 至 A2. N1p1-A2. N1p15 和 A2. N2a1-A2. N2a15 至 A2. N2p1-A2. N2p15 类型的基团) 的上述结构的是编号为 A2. 1Na1-A2. 84Na15 至 A2. 1Np1-A2. 84Np15 和 A2. 1N1a1-A2. 84N1a15 至 A2. 1N1p1-A2. 84N1p15 和 A2. 1N2a1-A2. 84N2a15 至 A2. 1N2p1-A2. 84N2p15 的基团, 其中 Z 为 NR^N , R^N 具有上表 N 中各行的含义。

[0173] A2. Za1、A2. Z1a1 和 A2. Z2a1 类型的基团表示其中 3、4 和 5 位取代基为氢的相同结构。

[0174] 本发明的非常优选实施方案涉及其中 X^1 为 O 的式 I 化合物及其盐和 N-氧化物。这些化合物在下文也称为化合物 I1:

[0175]



[0176] 在式 I1 中, 变量 A、 R^1 、 R^t 、 R^u 、V 和 W 如本文所定义。

[0177] 在式 I1 化合物中, 优选其中基团 R^1 、 R^t 、 R^u 、V 和 W 中至少一个, 优选基团 R^1 、 R^t 、 R^u 、V 和 W 中至少两个, 更优选所有基团 R^1 、 R^t 、 R^u 、V 和 W 具有优选含义之一的那些化合物。

[0178] 本发明所定义的化合物中优选的基团 R^1 为选自氢、 C_1 - C_{10} 烷基、 C_1 - C_{10} 卤代烷基、 C_1 - C_4 亚烷基 -CN、杂环基 - C_1 - C_5 烷基、杂芳基 - C_1 - C_5 烷基、 C_1 - C_5 亚烷基 -OR^a 和 C_3 - C_{10} 环烷基 - C_1 - C_5 烷基的基团 R^1 。

[0179] 本发明所定义的化合物中更优选的基团 R^1 为选自氢、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基和 C_1 - C_3 亚烷基 -O- C_1 - C_3 烷基的基团 R^1 。

[0180] 本发明所定义的化合物中进一步更优选的基团 R^1 为选自氢和甲基的基团 R^1 。

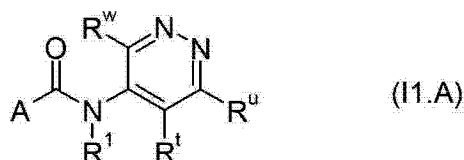
[0181] 在式 I1 化合物中, 进一步优选其中 A 为基团 A1, 例如选自咪唑基团 A1. 0a1-A1. 02p15 的基团的那些化合物。

[0182] 在式 I1 化合物中, 进一步优选其中 A 为基团 A1, 例如选自噻吩基团 A1. Sa1 至 A1. S2p15 的基团的那些化合物。

[0183] 在式 I1 化合物中, 进一步优选其中 A 为基团 A1, 例如选自吡咯基团 A1. Na1 至 A1. 84N2p15 的基团的那些化合物。

[0184] 本发明的特别优选实施方案涉及如下式 I1. A 化合物及其盐和 N-氧化物:

[0185]



[0186] 其中 A 为如本文所定义的基团 A1, 尤其是其中 R^1 具有优选含义的基团 A1, 尤其是式 A1. 0a 至 A1. 0o 的咪唑基团, 例如选自异噻唑基团 A1. 0a1 至 A1. 01o15 的基团;

[0187] R^1 为氢、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_3 亚烷基 -O- C_1 - C_3 烷基, 最优选氢、甲基或

乙基；

[0188] R^1 进一步最优选由下表 B 的各行 (1-77) 所表示；

[0189] R^t 、 R^u 和 R^v 相互独立地选自氢、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、二氟甲氧基和三氟甲氧基；以及其中优选基团 R^t 、 R^u 和 R^v 中至少一个，更优选 2 或 3 个为氢。

[0190] 表 B：

[0191]

序号	R^1
B-1	CH ₃
B-2	CH ₂ CH ₃
B-3	丙基
B-4	异丙基
B-5	丁基
B-6	异丁基
B-7	叔丁基
B-8	CH ₂ C(CH ₃) ₃
B-9	CH ₂ CH=CH ₂
B-10	CH ₂ CH=CCl ₂
B-11	CH ₂ CH=CBr ₂
B-12	CH ₂ CH ₂ F
B-13	CH ₂ CH ₂ Cl
B-14	CH ₂ CH ₂ Br
B-15	CH ₂ CHF ₂
B-16	CH ₂ CHCl ₂
B-17	CH ₂ CHBr ₂
B-18	CH ₂ CF ₃
B-19	CH ₂ CN
B-20	CH ₂ OCH ₃
B-21	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
B-22	CH ₂ CH ₂ CN
B-23	CH(CH ₃)CH ₂ CN
B-24	2-甲氧基乙基
B-25	2-乙氧基乙基
B-26	环丙基甲基
B-27	环丁基甲基
B-28	环戊基甲基
B-29	氧杂环丁烷-2-基甲基
B-30	氧杂环丁烷-3-基甲基
B-31	氧杂戊环-2-基甲基
B-32	氧杂戊环-3-基甲基
B-33	硫杂环丁烷-3-基甲基

序号	R^1
B-34	1,1-二氧杂硫杂环丁烷-3-基甲基
B-35	环丙基
B-36	环丁基
B-37	环戊基
B-38	氧杂环丁烷-2-基
B-39	氧杂环丁烷-3-基
B-40	氧杂戊环-2-基
B-41	氧杂戊环-3-基
B-42	硫杂环丁烷-3-基
B-43	1,1-二氧杂硫杂环丁烷-3-基
B-44	苄基
B-45	2-咪唑基甲基
B-46	3-咪唑基甲基
B-47	2-噁吩基甲基
B-48	3-噁吩基甲基
B-49	异噁唑-3-基甲基
B-50	异噁唑-4-基甲基
B-51	异噁唑-5-基甲基
B-52	异噁唑-3-基甲基
B-53	噁唑-2-基甲基
B-54	噁唑-5-基甲基
B-55	噁唑-4-基甲基
B-56	噁唑-2-基甲基
B-57	噁唑-4-基甲基
B-58	噁唑-5-基甲基
B-59	1H-吡唑-3-基甲基
B-60	1H-吡唑-4-基甲基
B-61	2H-吡唑-3-基甲基
B-62	1-CH ₃ -1H-吡唑-3-基甲基
B-63	1-CH ₃ -1H-吡唑-4-基甲基
B-64	2-CH ₃ -2H-吡唑-3-基甲基
B-65	1H-咪唑-2-基甲基

[0192]

序号	R ¹
B-66	1H-咪唑-4-基甲基
B-67	1H-咪唑-5-基甲基
B-68	1-CH ₃ -1H-咪唑-2-基甲基
B-69	1-CH ₃ -1H-咪唑-4-基甲基
B-70	1-CH ₃ -1H-咪唑-5-基甲基
B-71	噁唑啉-2-基甲基

序号	R ¹
B-72	噻唑啉-2-基甲基
B-73	1H-咪唑啉-2-基甲基
B-74	1-CH ₃ -1H-咪唑啉-2-基甲基
B-75	1-苯基吡唑-4-基甲基
B-76	5-CH ₃ -咪喃-2-基甲基
B-77	5,5-二甲基四氢咪喃-2-基甲基

[0193] 该特别优选实施方案的化合物实例是下表 1-29 中所给化合物：

[0194] 表 1：其中 R¹、R^t、R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1.0a1 至 A1.0a15 的式 I1.A 化合物。

[0195] 表 2：其中 R¹、R^t、R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1.0b1 至 A1.0b15 的式 I1.A 化合物。

[0196] 表 3：其中 R¹、R^t、R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1.0c1 至 A1.0c15 的式 I1.A 化合物。

[0197] 表 4：其中 R¹、R^t、R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1.0d1 至 A1.0d15 的式 I1.A 化合物。

[0198] 表 5：其中 R¹、R^t、R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1.0e1 至 A1.0e15 的式 I1.A 化合物。

[0199] 表 6：其中 R¹、R^t、R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1.0f1 至 A1.0f15 的式 I1.A 化合物。

[0200] 表 7：其中 R¹、R^t、R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1.0g1 至 A1.0g15 的式 I1.A 化合物。

[0201] 表 8：其中 R¹、R^t、R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1.0h1 至 A1.0h15 的式 I1.A 化合物。

[0202] 表 9：其中 R¹、R^t、R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1.0i1 至 A1.0i15 的式 I1.A 化合物。

[0203] 表 10：其中 R¹、R^t、R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1.0k1 至 A1.0k15 的式 I1.A 化合物。

[0204] 表 11：其中 R¹、R^t、R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1.0l1 至 A1.0l15 的式 I1.A 化合物。

[0205] 表 12：其中 R¹、R^t、R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1.0m1 至 A1.0m15 的式 I1.A 化合物。

[0206] 表 13：其中 R¹、R^t、R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1.0n1 至 A1.0n15 的式 I1.A 化合物。

[0207] 表 14：其中 R¹、R^t、R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1.0o1 至 A1.0o15 的式 I1.A 化合物。

[0208] 表 15：其中 R¹、R^t、R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1.01a1 至 A1.01a15 的式 I1.A 化合物。

[0209] 表 16：其中 R¹、R^t、R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1.01b1 至 A1.01b15 的式 I1.A

化合物。

[0210] 表 17 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. 01c1 至 A1. 01c15 的式 I1. A 化合物。

[0211] 表 18 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. 01d1 至 A1. 01d15 的式 I1. A 化合物。

[0212] 表 19 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. 01e1 至 A1. 01e15 的式 I1. A 化合物。

[0213] 表 20 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. 01f1 至 A1. 01f15 的式 I1. A 化合物。

[0214] 表 21 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. 01g1 至 A1. 01g15 的式 I1. A 化合物。

[0215] 表 22 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. 01h1 至 A1. 01h15 的式 I1. A 化合物。

[0216] 表 23 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. 01i1 至 A1. 01i15 的式 I1. A 化合物。

[0217] 表 24 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. 01k1 至 A1. 01k15 的式 I1. A 化合物。

[0218] 表 25 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. 01l1 至 A1. 01l15 的式 I1. A 化合物。

[0219] 表 26 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. 01m1 至 A1. 01m15 的式 I1. A 化合物。

[0220] 表 27 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. 01n1 至 A1. 01n15 的式 I1. A 化合物。

[0221] 表 28 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. 01o1 至 A1. 01o15 的式 I1. A 化合物。

[0222] 表 29 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. 01p1 至 A1. 01p15 的式 I1. A 化合物。

[0223] 该特别优选实施方案的其他化合物实例为类似于表 1-29 中所列化合物的化合物,其中 R^1 为上表 B 的各相应行 (1-77 行) 所示基团, R^t 、 R^u 和 R^w 为氢。

[0224] 另一特别优选实施方案涉及式 I1. A 化合物及其盐和 N-氧化物,其中 A 为如本文所定义的基团 A1,尤其是如下基团 A1,其中 R^A 具有优选含义,尤其是式 A1. Sa 至 A1. Sp 的噻吩基团,例如选自噻吩基团 A1. Sa1 至 A1. S1p15 的基团;

[0225] R^1 为氢、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_3 亚烷基 -O- C_1 - C_3 烷基,最优选氢、甲基或乙基;

[0226] R^1 进一步最优选由上表 B 的各行所定义的基团表示;

[0227] R^t 、 R^u 和 R^w 相互独立地选自氢、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、二氟甲氧基和三氟甲氧基;并且其中优选基团 R^t 、 R^u 和 R^w 中至少一个,更优选 2 或 3 个为氢。

[0228] 该特别优选实施方案的化合物实例是下表 30-58 中所给化合物。表 30 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Sa1 至 A1. Sa15

- [0229] 的式 I1. A 化合物。
- [0230] 表 31 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Sb1 至 A1. Sb15 的式 I1. A 化合物。
- [0231] 表 32 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Sc1 至 A1. Sc15 的式 I1. A 化合物。
- [0232] 表 33 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Sd1 至 A1. Sd15 的式 I1. A 化合物。
- [0233] 表 34 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Se1 至 A1. Se15 的式 I1. A 化合物。
- [0234] 表 35 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Sf1 至 A1. Sf15 的式 I1. A 化合物。
- [0235] 表 36 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Sg1 至 A1. Sg15 的式 I1. A 化合物。
- [0236] 表 37 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Sh1 至 A1. Sh15 的式 I1. A 化合物。
- [0237] 表 38 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Si1 至 A1. Si15 的式 I1. A 化合物。
- [0238] 表 39 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Sk1 至 A1. Sk15 的式 I1. A 化合物。
- [0239] 表 40 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Sl1 至 A1. Sl15 的式 I1. A 化合物。
- [0240] 表 41 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Sm1 至 A1. Sm15 的式 I1. A 化合物。
- [0241] 表 42 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Sn1 至 A1. Sn15 的式 I1. A 化合物。
- [0242] 表 43 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. So1 至 A1. So15 的式 I1. A 化合物。
- [0243] 表 44 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. S1a1 至 A1. S1a15 的式 I1. A 化合物。
- [0244] 表 45 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. S1b1 至 A1. S1b15 的式 I1. A 化合物。
- [0245] 表 46 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. S1c1 至 A1. S1c15 的式 I1. A 化合物。
- [0246] 表 47 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. S1d1 至 A1. S1d15 的式 I1. A 化合物。
- [0247] 表 48 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. S1e1 至 A1. S1e15 的式 I1. A 化合物。
- [0248] 表 49 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. S1f1 至 A1. S1f15 的式 I1. A 化合物。

[0249] 表 50 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. S1g1 至 A1. S1g15 的式 I1. A 化合物。

[0250] 表 51 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. S1h1 至 A1. S1h15 的式 I1. A 化合物。

[0251] 表 52 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. S1i1 至 A1. S1i15 的式 I1. A 化合物。

[0252] 表 53 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. S1k1 至 A1. S1k15 的式 I1. A 化合物。

[0253] 表 54 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. S1l1 至 A1. S1l15 的式 I1. A 化合物。

[0254] 表 55 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. S1m1 至 A1. S1m15 的式 I1. A 化合物。

[0255] 表 56 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. S1n1 至 A1. S1n15 的式 I1. A 化合物。

[0256] 表 57 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. S1o1 至 A1. S1o15 的式 I1. A 化合物。

[0257] 表 58 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. S1p1 至 A1. S1p15 的式 I1. A 化合物。

[0258] 该特别优选实施方案的其他化合物实例是类似于表 30-58 中所列化合物的化合物,其中 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢,其中 A 如表 59-87 中所定义且其中 R^1 为上表 B 的各相应行(1-77 行)所示基团。

[0259] 另一特别优选实施方案涉及式 I1. A 化合物及其盐和 N-氧化物,其中 A 为如本文所定义的基团 A1,尤其是如下基团 A1,其中 R^A 具有优选含义,尤其是式 A1. Na 至 A1. Np 的吡咯基团,例如选自吡咯基团 A1. Na1 至 A1. 84N1p15 的基团;

[0260] R^1 为氢、 C_1 - C_4 烷基或 C_1 - C_4 烷氧基 - C_1 - C_2 烷基,最优选氢、甲基或乙基;

[0261] R^1 进一步最优选由上表 B 的各行所定义的基团表示;

[0262] R^t 、 R^u 和 R^w 相互独立地选自氢、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、二氟甲氧基和三氟甲氧基;并且其中优选基团 R^t 、 R^u 和 R^w 中至少一个,优选 2 或 3 个为氢。

[0263] 该特别优选实施方案的化合物实例是下表 59-87 中所给化合物:

[0264] 表 59 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Na1 至 A1. Na15 的式 I1. A 化合物。

[0265] 表 60 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Nb1 至 A1. Nb15 的式 I1. A 化合物。

[0266] 表 61 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Nc1 至 A1. Nc15 的式 I1. A 化合物。

[0267] 表 62 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Nd1 至 A1. Nd15 的式 I1. A 化合物。

[0268] 表 63 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Ne1 至 A1. Ne15 的式 I1. A 化合物。

- [0269] 表 64 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Nf1 至 A1. Nf15 的式 I1. A 化合物。
- [0270] 表 65 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Ng1 至 A1. Ng15 的式 I1. A 化合物。
- [0271] 表 66 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Nh1 至 A1. Nh15 的式 I1. A 化合物。
- [0272] 表 67 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Ni1 至 A1. Ni15 的式 I1. A 化合物。
- [0273] 表 68 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Nk1 至 A1. Nk15 的式 I1. A 化合物。
- [0274] 表 69 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Nl1 至 A1. Nl15 的式 I1. A 化合物。
- [0275] 表 70 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Nm1 至 A1. Nm15 的式 I1. A 化合物。
- [0276] 表 71 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. Nn1 至 A1. Nn15 的式 I1. A 化合物。
- [0277] 表 72 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. No1 至 A1. No15 的式 I1. A 化合物。
- [0278] 表 73 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. N1a1 至 A1. N1a15 的式 I1. A 化合物。
- [0279] 表 74 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. N1b1 至 A1. N1b15 的式 I1. A 化合物。
- [0280] 表 75 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. N1c1 至 A1. N1c15 的式 I1. A 化合物。
- [0281] 表 76 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. N1d1 至 A1. n1d15 的式 I1. A 化合物。
- [0282] 表 77 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. N1e1 至 A1. N1e15 的式 I1. A 化合物。
- [0283] 表 78 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. N1f1 至 A1. N1f15 的式 I1. A 化合物。
- [0284] 表 79 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. N1g1 至 A1. N1g15 的式 I1. A 化合物。
- [0285] 表 80 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. N1h1 至 A1. N1h15 的式 I1. A 化合物。
- [0286] 表 81 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. N1i1 至 A1. N1i15 的式 I1. A 化合物。
- [0287] 表 82 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. N1k1 至 A1. N1k15 的式 I1. A 化合物。
- [0288] 表 83 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. N1l1 至 A1. N1l15 的式 I1. A

化合物。

[0289] 表 84 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. N1m1 至 A1. N1m15 的式 I1. A 化合物。

[0290] 表 85 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. N1n1 至 A1. N1n15 的式 I1. A 化合物。

[0291] 表 86 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. N1o1 至 A1. N1o15 的式 I1. A 化合物。

[0292] 表 87 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A1. N1p1 至 A1. N1p15 的式 I1. A 化合物。

[0293] 该特别优选实施方案的其他化合物实例是类似于表 59-87 的化合物的化合物,其中 R^t 、 R^u 和 R^v 为氢,其中 A 如表 59-87 所定义并且其中 R^1 为上表 B 的各相应行 (1-77 行) 所示基团。

[0294] 另一特别优选实施方案涉及式 I1. A 化合物及其盐和 N- 氧化物,其中 A 为如本文所定义的基团 A2,尤其是其中 R^A 具有优选含义的基团 A2,尤

[0295] 其是式 A2. 0a1-A2. 0p 的吡咯基团,例如选自吡咯基团 A2. 0a1-A2. 0a15 至 A2. 0p1-A2. 0p15 的基团;

[0296] R^1 为氢、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_3 亚烷基 -O- C_1 - C_3 烷基,最优选氢、甲基或乙基;

[0297] R^1 进一步最优选由上表 B 的各行所定义的基团表示;

[0298] R^t 、 R^u 和 R^w 相互独立地选自氢、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、二氟甲氧基和三氟甲氧基;并且其中优选基团 R^t 、 R^u 和 R^w 中至少一个,优选 2 或 3 个为氢。

[0299] 该特别优选实施方案的化合物实例是表 88-116 中所给化合物。

[0300] 表 88 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. 0a1-A2. 0a15 的式 I1. A 化合物。

[0301] 表 89 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. 0b1-A2. 0b15 的式 I1. A 化合物。

[0302] 表 90 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. 0c1-A2. 0c15 的式 I1. A 化合物。

[0303] 表 91 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. 0d1-A2. 0d15 的式 I1. A 化合物。

[0304] 表 92 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. 0e1-A2. 0e15 的式 I1. A 化合物。

[0305] 表 93 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. 0f1-A2. 0f15 的式 I1. A 化合物。

[0306] 表 94 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. 0g1-A2. 0g15 的式 I1. A 化合物。

[0307] 表 95 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. 0h1-A2. 0h15 的式 I1. A 化合物。

[0308] 表 96 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. 0i1-A2. 0i15 的式 I1. A 化

合物。

[0309] 表 97 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.0k1-A2.0k15 的式 I1. A 化合物。

[0310] 表 98 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.011-A2.0115 的式 I1. A 化合物。

[0311] 表 99 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.0m1-A2.0m15 的式 I1. A 化合物。

[0312] 表 100 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.0n1-A2.0n15 的式 I1. A 化合物。

[0313] 表 101 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.0o1-A2.0o15 的式 I1. A 化合物。

[0314] 表 102 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.01a1-A2.01a15 的式 I1. A 化合物。

[0315] 表 103 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.01b1-A2.01b15 的式 I1. A 化合物。

[0316] 表 104 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.01c1-A2.01c15 的式 I1. A 化合物。

[0317] 表 105 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.01d1-A2.01d15 的式 I1. A 化合物。

[0318] 表 106 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.01e1-A2.01e15 的式 I1. A 化合物。

[0319] 表 107 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.01f1-A2.01f15 的式 I1. A 化合物。

[0320] 表 108 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.01g1-A2.01g15 的式 I1. A 化合物。

[0321] 表 109 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.01h1-A2.01h15 的式 I1. A 化合物。

[0322] 表 110 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.01i1-A2.01i15 的式 I1. A 化合物。

[0323] 表 111 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.01k1-A2.01k15 的式 I1. A 化合物。

[0324] 表 112 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.0111-A2.01115 的式 I1. A 化合物。

[0325] 表 113 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.01m1-A2.01m15 的式 I1. A 化合物。

[0326] 表 114 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.01n1-A2.01n15 的式 I1. A 化合物。

[0327] 表 115 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2.01o1-A2.01o15 的式 I1. A 化合物。

[0328] 表 116 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. 01p1-A2. 01p15 的式 I1. A 化合物。

[0329] 该特别优选实施方案的其他化合物实例是类似于表 85-112 的化合物的化合物, 其中 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢, 其中 A 如表 85-112 所定义并且其中 R^1 为上表 B 的各相应行 (1-74 行) 所示基团。

[0330] 另一特别优选实施方案涉及式 I1. A 化合物及其盐和 N- 氧化物, 其中 A 为如本文所定义的基团 A2, 尤其是其中 R^A 具有优选含义的基团 A2, 尤

[0331] 其是式 A2. Sa 至 A2. So 的噻吩基团, 例如选自噻吩基团 A2. Sa1-A2. S1o15 的基团;

[0332] R^1 为氢、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_3 亚烷基 -O- C_1 - C_3 烷基, 最优选氢、甲基或乙基;

[0333] R^1 进一步最优选由上表 B 的各行所定义的基团表示;

[0334] R^t 、 R^u 和 R^w 相互独立地选自氢、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、二氟甲氧基和三氟甲氧基; 并且其中优选基团 R^t 、 R^u 和 R^w 中至少一个, 优选 2 或 3 个为氢。

[0335] 该特别优选实施方案的化合物实例是表 117-155 中所给化合物:

[0336] 表 117 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Sa1-A2. Sa15 的式 I1. A 化合物。

[0337] 表 118 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Sb1-A2. Sb15 的式 I1. A 化合物。

[0338] 表 119 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Sc1-A2. Sc15 的式 I1. A 化合物。

[0339] 表 120 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Sd1-A2. Sd15 的式 I1. A 化合物。

[0340] 表 121 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Se1-A2. Se15 的式 I1. A 化合物。

[0341] 表 122 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Sf1-A2. Sf15 的式 I1. A 化合物。

[0342] 表 123 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Sg1-A2. Sg15 的式 I1. A 化合物。

[0343] 表 124 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Sh1-A2. Sh15 的式 I1. A 化合物。

[0344] 表 125 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Si1-A2. Si15 的式 I1. A 化合物。

[0345] 表 126 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Sk1-A2. Sk15 的式 I1. A 化合物。

[0346] 表 127 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Sl1-A2. Sl15 的式 I1. A 化合物。

[0347] 表 128 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Sm1-A2. Sm15 的式 I1. A 化合物。

[0348] 表 129 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Sn1-A2. Sn15 的式 I1. A 化

合物。

[0349] 表 130 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. So1-A2. So15 的式 I1. A 化合物。

[0350] 表 131 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. S1a1-A2. S1a15 的式 I1. A 化合物。

[0351] 表 132 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. S1b1-A2. S1b15 的式 I1. A 化合物。

[0352] 表 133 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. S1c1-A2. S1c15 的式 I1. A 化合物。

[0353] 表 134 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. S1d1-A2. S1d15 的式 I1. A 化合物。

[0354] 表 135 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. S1e1-A2. S1e15 的式 I1. A 化合物。

[0355] 表 136 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. S1f1-A2. S1f15 的式 I1. A 化合物。

[0356] 表 137 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. S1g1-A2. S1g15 的式 I1. A 化合物。

[0357] 表 138 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. S1h1-A2. S1h15 的式 I1. A 化合物。

[0358] 表 139 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. S1i1-A2. S1i15 的式 I1. A 化合物。

[0359] 表 140 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. S1k1-A2. S1k15 的式 I1. A 化合物。

[0360] 表 141 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. S1l1-A2. S1l15 的式 I1. A 化合物。

[0361] 表 142 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. S1m1-A2. S1m15 的式 I1. A 化合物。

[0362] 表 143 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. S1n1-A2. S1n15 的式 I1. A 化合物。

[0363] 表 144 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. S1o1-A2. S1o15 的式 I1. A 化合物。

[0364] 表 145 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. S1p1-A2. S1p15 的式 I1. A 化合物。

[0365] 该特别优选实施方案的其他化合物实例是类似于表 117-145 的化合物的化合物, 其中 R^t 、 R^u 和 R^v 为氢, 其中 A 如表 117-145 所定义并且其中 R^1 为上表 B 的各相应行 (1-77 行) 所示基团。

[0366] 另一特别优选实施方案涉及式 I1. A 化合物及其盐和 N- 氧化物, 其中 A 为如本文所定义的基团 A2, 尤其是其中 R^A 具有优选含义的基团 A2, 尤

[0367] 其是式 A2. Na 至 A2. No 的吡咯基团, 例如选自吡咯基团 A2. Na1-A2. 84N1o15 的基

团；

[0368] R^1 为氢、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_3 亚烷基 - $O-C_1-C_3$ 烷基, 最优选氢、甲基或乙基；

[0369] R^1 进一步最优选由上表 B 的各行所定义的基团表示；

[0370] R^t 、 R^u 和 R^w 相互独立地选自氢、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、二氟甲氧基和三氟甲氧基；并且其中优选基团 R^t 、 R^u 和 R^w 中至少一个, 优选 2 或 3 个为氢。

[0371] 该特别优选实施方案的化合物实例是下表 146-174 中所给化合物；

[0372] 表 146 : 其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Na1-A2. Na15 的式 I1. A 化合物。

[0373] 表 147 : 其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Nb1-A2. Nb15 的式 I1. A 化合物。

[0374] 表 148 : 其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Nc1-A2. Nc15 的式 I1. A 化合物。

[0375] 表 149 : 其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Nd1-A2. Nd15 的式 I1. A 化合物。

[0376] 表 150 : 其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Ne1-A2. Ne15 的式 I1. A 化合物。

[0377] 表 151 : 其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Nf1-A2. Nf15 的式 I1. A 化合物。

[0378] 表 152 : 其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Ng1-A2. Ng15 的式 I1. A 化合物。

[0379] 表 153 : 其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Nh1-A2. Nh15 的式 I1. A 化合物。

[0380] 表 154 : 其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Ni1-A2. Ni15 的式 I1. A 化合物。

[0381] 表 155 : 其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Nk1-A2. Nk15 的式 I1. A 化合物。

[0382] 表 156 : 其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Nl1-A2. Nl15 的式 I1. A 化合物。

[0383] 表 157 : 其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Nm1-A2. Nm15 的式 I1. A 化合物。

[0384] 表 158 : 其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. Nn1-A2. Nn15 的式 I1. A 化合物。

[0385] 表 159 : 其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. No1-A2. No15 的式 I1. A 化合物。

[0386] 表 160 : 其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. N1a1-A2. N1a15 的式 I1. A 化合物。

[0387] 表 161 : 其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. N1b1-A2. N1b15 的式 I1. A 化合物。

[0388] 表 162 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. N1c1-A2. N1c15 的式 I1. A 化合物。

[0389] 表 163 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. N1d1-A2. n1d15 的式 I1. A 化合物。

[0390] 表 164 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. N1e1-A2. N1e15 的式 I1. A 化合物。

[0391] 表 165 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. N1f1-A2. N1f15 的式 I1. A 化合物。

[0392] 表 166 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. N1g1-A2. N1g15 的式 I1. A 化合物。

[0393] 表 167 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. N1h1-A2. N1h15 的式 I1. A 化合物。

[0394] 表 168 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. N1i1-A2. N1i15 的式 I1. A 化合物。

[0395] 表 169 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. N1k1-A2. N1k15 的式 I1. A 化合物。

[0396] 表 170 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. N1l1-A2. N1l15 的式 I1. A 化合物。

[0397] 表 171 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. N1m1-A2. N1m15 的式 I1. A 化合物。

[0398] 表 172 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. N1n1-A2. N1n15 的式 I1. A 化合物。

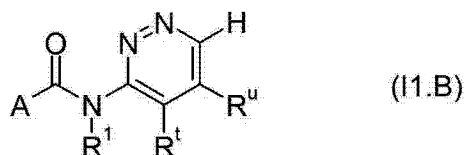
[0399] 表 173 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. N1o1-A2. N1o15 的式 I1. A 化合物。

[0400] 表 174 :其中 R^1 、 R^t 、 R^u 和 R^w 为氢且其中 A 选自基团 A2. N1p1-A2. N1p15 的式 I1. A 化合物。

[0401] 该特别优选实施方案的其他化合物实例是类似于表 146-174 的化合物的化合物, 其中 R^t 、 R^u 和 R^v 为氢, 其中 A 如表 146-174 所定义并且其中 R^1 为上表 B 的各相应行 (1-77 行) 所示基团, R^t 、 R^u 和 R^v 为氢。

[0402] 本发明的其他特别优选实施方案涉及式 I1. B 化合物及其盐和 N-氧化物:

[0403]



[0404] 其中

[0405] A 为如本发明所定义的基团 A1 或 A2 ;

[0406] R^1 为氢、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_3 亚烷基 - O - C_1 - C_3 烷基, 最优选氢、甲基或乙基 ;

[0407] R^1 进一步最优选由上表 B 的各行所定义的基团表示 ;

[0408] R^t 和 R^u 相互独立地选自氢、甲基、二氟甲基、三氟甲基、甲氧基、二氟甲氧基和三氟甲氧基；并且其中优选基团 R^t 、 R^u 中至少一个，更优选 2 个。

[0409] 特别优选实施方案涉及如下式 I1. B 化合物，其中 R^t 、 R^u 、 R^1 如上所定义且其中 A 为基团 A1，尤其是其中 R^A 具有优选含义的基团 A1，尤其是式 A1. 0a 至 A1. 0p 的吡咯基团，例如选自吡咯基团 A1. 0a1 至 A1. 0p15 的基团；

[0410] 该特别优选实施方案的化合物实例是下表 175-202 中所给化合物。表 175-202：其中 R^t 、 R^u 和 R^v 为氢且其中 A 和 R^1 如表 1-28 所定义的式

[0411] I1. B 化合物。

[0412] 另一特别优选实施方案涉及如下式 I1. B 化合物及其盐和 N-氧化物，其中 R^t 、 R^u 、 R^1 如上所定义并且其中

[0413] A 为如本文所定义的基团 A1，尤其是其中 R^A 具有优选含义的基团 A1，尤其是式 A1. Sa 至 A1. Sp 的噻吩基团，例如选自异噻唑基团 A1. Sa1 至 A1. Sp15 的基团。

[0414] 该特别优选实施方案的化合物实例是下表 203-231 中所给化合物。表 203-231：其中 R^t 和 R^u 为氢并且其中 A 和 R^1 如表 30-58 中所定义的式 I1. B 化合物。

[0415] 另一特别优选实施方案涉及如下式 I1. B 化合物及其盐和 N-氧化物，其中 R^t 、 R^u 、 R^1 如上所定义并且其中

[0416] A 为如本文所定义的基团 A1，尤其是如下基团 A1，其中 R^A 具有优选含义，尤其是式 A1. Na 至 A1. Np 的噻吩基团，例如选自异噻唑基团 A1. Na1 至 A1. 84Np15 的基团。

[0417] 该特别优选实施方案的化合物实例是下表 232-260 中所给化合物。

[0418] 表 232-260：其中 R^t 和 R^u 为氢并且其中 A 和 R^1 如表 59-87 中所定义的式 I1. B 化合物。

[0419] 另一特别优选实施方案涉及如下式 I1. B 化合物及其盐和 N-氧化物，其中 R^t 、 R^u 、 R^1 如上所定义并且其中

[0420] A 为如本文所定义的基团 A2，尤其是其中 R^A 具有优选含义的基团 A2，尤其是式 A2. 0a 至 A2. 0p 的吡咯基团，例如选自吡咯基团 A2. 0a1-A2. 0p15 的基团；

[0421] 该特别优选实施方案的化合物实例是下表 261-289 中所给化合物。

[0422] 表 261-289：其中 R^t 和 R^u 为氢并且其中 A 和 R^1 如表 88-116 中所定义的式 I1. B 化合物。

[0423] 另一特别优选实施方案涉及如下式 I1. B 及化合物其盐和 N-氧化物，其中 R^t 、 R^u 、 R^1 如上所定义并且其中

[0424] A 为如本文所定义的基团 A2，尤其是其中 R^A 具有优选含义的基团 A2，尤其是式 A2. Sa 至 A2. Sp 的噻吩基团，例如选自异噻唑基团 A2. Sa1-A2. Sp15 的基团。

[0425] 该特别优选实施方案的化合物实例是下表 290-318 中所给化合物。表 290-318：其中 R^t 和 R^u 为氢并且其中 A 和 R^1 如表 117-145 中所定义的

[0426] 式 I1. B 化合物。

[0427] 另一特别优选实施方案涉及如下式 I1. B 化合物及其盐和 N-氧化物，其中 R^t 、 R^u 、 R^1 如上所定义并且其中

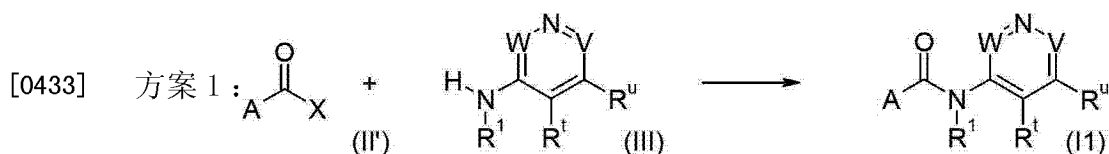
[0428] A 为如本文所定义的基团 A2，尤其是其中 R^A 具有优选含义的基团 A1，尤其是式 A2. Na 至 A2. Np 的噻吩基团，例如选自异噻唑基团 A2. Na1-A2. 84Np15 的基团；

[0429] 该特别优选实施方案的化合物实例是下表 319-347 中所给化合物。

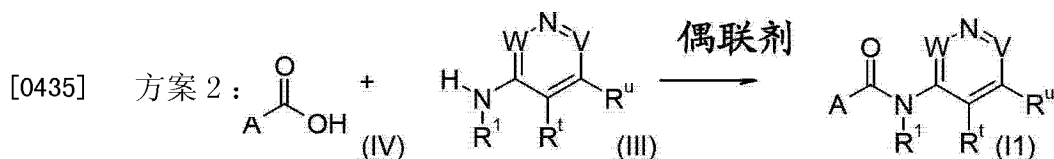
[0430] 表 319-347 ;其中 R^t、R^u 和 R^v 为氢并且其中 A 和 R¹ 如表 146-174 中所定义的式 I1. B 化合物。

[0431] 这些优选实施方案的其他实例由上文所定义的本发明优选化合物的盐和 N- 氧化物代表。

[0432] 其中 X¹ 为 O 的式 I 化合物 (化合物 I1) 例如可以根据方案 1 所示方法通过使活化的呋喃、噻吩或吡咯羧酸衍生物 II' 与 3- 或 4- 氨基吡嗪化合物 III 反应而制备 (例如参见 Houben-Weyl :“Methoden der organ. Chemie”[有机化学方法], Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart, New York 1985, 第 E5 卷, 第 941-1045 页)。活化的呋喃、噻吩或吡咯羧酸衍生物 II 例如为酰氯、活化酯、酸酐、酰基叠氮化物, 其中 X 例如为氯、氟、溴、对硝基苯氧基、五氟苯氧基、N- 羟基琥珀酰亚胺、羟基苯并三唑-1-基。在方案 1 中, 基团 A、R¹、R^t、R^u、V 和 W 具有上述含义, 尤其是作为优选提到的含义。

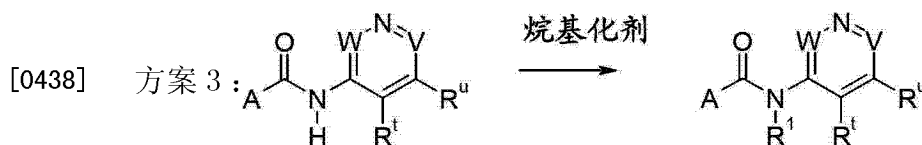


[0434] 其中 X¹ 为 O 的式 I 化合物 (化合物 I1) 例如还可以根据方案 2 通过在偶联剂存在下使呋喃、噻吩或吡咯羧酸 IV 与 3- 或 4- 氨基吡嗪化合物 III 反应而制备。在方案 2 中, 基团 A、R¹、R^u、V 和 W 具有上述含义, 尤其是作为优选提到的含义。



[0436] 合适的偶联剂例如为基于碳二亚胺的偶联剂, 例如 N, N'- 二环己基碳二亚胺 [J. C. Sheehan, G. P. Hess, J. Am. Chem. Soc. 1955, 77, 1067], N-(3-二甲氨基丙基)-N'-乙基碳二亚胺; 与碳酸酯形成混合酸酐的偶联剂, 例如 2-乙氧基-1-乙氧羰基-1, 2-二氢喹啉 [B. Belleau, G. Malek, J. Amer. Chem. Soc. 1968, 90, 1651]、2-异丁氧基-1-异丁氧羰基-1, 2-二氢喹啉 [Y. Kiso, H. Yajima, J. Chem. Soc., Chem. Commun. 1972, 942]; 基于磷盐的偶联剂, 例如 (苯并三唑-1-基氧基) 三(二甲氨基)磷六氟磷酸盐 [B. Castro, J. R. Domoy, G. Evin, C. Selve, Tetrahedron Lett. 1975, 14, 1219]、(苯并三唑-1-基氧基) 三吡咯烷基磷六氟磷酸盐 [J. Coste 等, Tetrahedron Lett. 1990, 31, 205]; 基于脲鎓 (uranium) 盐或具有脲鎓 N-氧化物结构的偶联剂, 例如 N, N, N', N'-四甲基-O-(1H-苯并三唑-1-基)脲鎓六氟磷酸盐 [R. Knorr, A. Trzeciak, W. Bannwarth, D. Gillesen, Tetrahedron Lett. 1989, 30, 1927], N, N, N', N'-四甲基-O-(苯并三唑-1-基)脲鎓四氟硼酸盐, (苯并三唑-1-基氧基) 二哌啶子基碳鎓六氟磷酸盐 [S. Chen, J. Xu, Tetrahedron Lett. 1992, 33, 647]; 形成酰氯的偶联剂, 例如二(2-氧代噁唑烷基)膦酰氯 [J. Diago-Mesequer, Synthesis 1980, 547]。

[0437] 其中 X¹ 为 O (化合物 I1) 和 R¹ 不为氢的式 I 化合物还可以通过用合适的烷基化剂在碱存在下烷基化酰胺 I (其中 R¹ 为氢且可以根据方案 1 或 2 得到) 而制备。



[0439] 咪喃、噻吩或吡咯羧酸 IV 及其活化衍生物 II 以及 3- 或 4- 氨基哒嗪化合物 III 在本领域是已知的或者可以市购或者可以通过由文献已知的方法制备。

[0440] 其中 X^1 不为氧的式 I 化合物可以通过标准方法由式 II 化合物制备:

[0441] 其中 X^1 为 S 的式 I 化合物例如可以通过使式 II 化合物与 2, 4- 二 (4- 甲氧基苯基)-1, 3, 2, 4- 二硫杂二磷杂己环 (dithiadiphosphetane)-2, 4- 二硫化物或五硫化二磷根据 M. Jesberger 等在 Synthesis 2003, 1929 中所述方法反应而制备。

[0442] 其中 X^1 为 NR^{1a} 的式 I 化合物例如可以通过使化合物 II 与 2, 4- 二 (4- 甲氧基苯基)-1, 3, 2, 4- 二硫杂二磷杂己环-2, 4- 二硫化物反应以得到对应的硫代酰胺 (化合物 I, 其中 X^1 为 S) 并随后使其与合适的胺根据 V. Glushkov 等在 Pharmaceutical Chemistry Journal 2005, 39 (10), 533-536 中所述方法反应而制备。

[0443] 其中 $X^2=SR^{2a}$ 的式 II 化合物可以通过与烷基化剂根据 V. Glushkov 等在 Pharmaceutical Chemistry Journal 2005, 39 (10), 533-536 中所述方法反应以烷基化对应的硫代酰胺 (化合物 I, 其中 X^1 为 S) 而制备。以类似方式可以得到其中 X^2 为 OR^{2a} 或 $NR^{2b}R^{2c}$ 的化合物 I。其中 $X^2=SOR^{2a}$ 或 SO_2R^{2a} 的式 II 化合物可以通过氧化其中 $X^2=SR^{2a}$ 的化合物 II 而得到。

[0444] 式 I 和 II 化合物的 N- 氧化物可以通过根据制备杂芳族 N- 氧化物的标准方法, 例如通过 C. Botteghi 等在 Journal of Organometallic Chemistry 1989, 370, 17-31 中所述方法氧化化合物 I 而制备。

[0445] 式 I 或 II 化合物通常可以通过上述方法制备。若各化合物不能经由上述途径制备, 则它们可以借助对所述合成途径的常规改变通过衍生其他化合物 I 或 II 而制备。例如, 在各种情况下, 某些化合物 I 或 II 可以有利地通过酯水解、酰胺化、酯化、醚裂解、烯炔化、还原、氧化等由其他化合物 I 或 II 制备。

[0446] 反应混合物以常规方式后处理, 例如通过与水混合、分离各相并且合适的话通过层析, 例如在矾土或硅胶上层析而提纯粗产物。一些中间体和终产物可以以无色或浅棕色粘稠油形式得到, 将它们在减压和温和升高的温度下由挥发性组分取出或提纯。若中间体和终产物以固体得到, 则它们可以通过重结晶或研制进行提纯。

[0447] 由于其优异的活性, 通式 I 或 II 的化合物可以用于防治无脊椎动物害虫。

[0448] 因此, 本发明还提供了一种防治无脊椎动物害虫的方法, 该方法包括用杀虫有效量的如上所定义的式 (I) 或 (II) 化合物或其盐或 N- 氧化物或组合物处理害虫、其食物供应源、其栖息地或其繁殖地或其中害虫生长或可能生长的栽培植物、植物繁殖材料 (如种子)、土壤、区域、材料或环境或者要防止害虫侵袭或侵染的材料、栽培植物、植物繁殖材料 (如种子)、土壤、表面或空间。

[0449] 优选本发明方法用于保护植物繁殖材料 (如种子) 和由其生长的植物以防无脊椎动物害虫侵袭或侵染且包括用杀虫有效量的如上所定义的式 (I) 或 (II) 化合物或其可农用盐或 N- 氧化物或用杀虫有效量的如上文和下文所定义的农业组合物处理植物繁殖材料 (如种子)。本发明方法不限于保护已经根据本发明处理的“底物”(植物、植物繁殖材料、土

壤材料等),而是还具有预防效果,因此例如可以相应地保护由已处理的植物繁殖材料(如种子)生长的植物,但植物本身并未被处理。

[0450] 就本发明而言,“无脊椎动物害虫”优选选自节肢动物害虫和线虫,更优选选自有害昆虫、蜘蛛和线虫,甚至更优选选自昆虫、螨虫和线虫。就本发明而言,“无脊椎动物害虫”最优选为昆虫,优选同翅目(Homoptera)昆虫。

[0451] 本发明进一步提供了一种防除该类无脊椎动物害虫的农业组合物,其包含具有杀虫作用量的至少一种通式 I 或 II 的化合物或至少一种其可农用盐或 N-氧化物和至少一种惰性液体和/或固体可农用载体以及需要的话至少一种表面活性剂。

[0452] 该组合物可以含有式 I 或 II 的单一活性化合物或其 N-氧化物或几种本发明活性化合物 I 或 II 或其盐的混合物。本发明组合物可以包含单独的异构体或异构体混合物以及单独的互变异构体或互变异构体混合物。

[0453] 式 I 或 II 化合物和包含它们的杀虫组合物是防治节肢动物害虫和线虫的有效试剂。由式 I 或 II 化合物防治的无脊椎动物害虫例如包括:鳞翅目昆虫(鳞翅目(Lepidoptera)),例如小地老虎(*Agrotis ypsilon*)、黄地老虎(*Agrotis segetum*)、木棉虫(*Alabama argillacea*)、黎豆夜蛾(*Anticarsia gemmatalis*)、*Argyresthia conjugella*、叉纹夜蛾(*Autographa gamma*)、树尺蠖(*Bupalus piniarius*)、*Cacoecia murinana*、*Capua reticulana*、*Cheimatobia brumata*、云杉色卷蛾(*Choristoneura fumiferana*)、*Choristoneura occidentalis*、二化螟(*Cirphis unipuncta*)、苹果小卷蛾(*Cydia pomonella*)、松毛虫(*Dendrolimus pini*)、*Diaphania nitidalis*、西南玉米秆草螟(*Diatraea grandiosella*)、埃及钻夜蛾(*Earias insulana*)、南美玉米苗斑螟(*Elasmopalpus lignosellus*)、女贞细卷蛾(*Eupoecilia ambiguella*)、*Evetria bouliana*、*Feltia subterranea*、蜡螟(*Galleria mellonella*)、李小食心虫(*Grapholitha funebrana*)、梨小食心虫(*Grapholitha molesta*)、棉铃虫(*Heliothis armigera*)、烟芽夜蛾(*Heliothis virescens*)、玉米穗虫(*Heliothis zea*)、菜螟(*Hellula undalis*)、*Hibernia defoliaria*、美国白蛾(*Hyphantria cunea*)、苹果巢蛾(*Hyponomeuta malinellus*)、番茄虫蛾(*Keiferia lycopersicella*)、*Lambdina fiscellaria*、甜菜夜蛾(*Laphygma exigua*)、咖啡潜叶蛾(*Leucoptera coffeella*)、旋纹潜蛾(*Leucoptera scitella*)、*Lithocolletis blancardella*、葡萄浆果小卷蛾(*Lobesia botrana*)、甜菜网螟(*Loxostege sticticalis*)、舞毒蛾(*Lymantria dispar*)、模毒蛾(*Lymantria monacha*)、桃潜蛾(*Lyonetia clerkella*)、黄褐天幕毛虫(*Malacosoma neustria*)、甘蓝夜蛾(*Mamestra brassicae*)、黄杉毒蛾(*Orgyia pseudotsugata*)、玉米螟(*Ostrinia nubilalis*)、小眼夜蛾(*Panolis flammea*)、棉花红铃虫(*Pectinophora gossypiella*)、疆夜蛾(*Peridroma saucia*)、圆掌舟蛾(*Phalera bucephala*)、马铃薯麦蛾(*Phthorimaea operculella*)、柑桔潜叶蛾(*Phyllocnistis citrella*)、欧洲粉蝶(*Pieris brassicae*)、苜蓿绿夜蛾(*Plathypena scabra*)、菜蛾(*Plutella xylostella*)、大豆夜蛾(*Pseudoplusia includens*)、*Rhyacionia frustrana*、*Scrobipalpula absoluta*、麦蛾(*Sitotroga cerealella*)、葡萄卷叶蛾(*Sparganothis pilleriana*)、草地夜蛾(*Spodoptera frugiperda*)、海灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis*)、斜纹夜蛾(*Spodoptera litura*)、*Thaumtopoea pityocampa*、绿色橡木飞蛾(*Tortrix viridana*)、粉纹夜蛾(*Trichoplusia*

ni) 和 *Zeiraphera canadensis*;

[0454] 甲虫 (鞘翅目 (Coleoptera)), 例如梨窄吉丁 (*Agrilus sinuatus*)、直条叩头虫 (*Agriotes lineatus*)、暗色叩头虫 (*Agriotes obscurus*)、*Amphimallus solstitialis*、*Anisandrus dispar*、墨西哥棉铃象 (*Anthonomus grandis*)、苹花象 (*Anthonomus pomorum*)、甜菜隐食甲 (*Atomaria linearis*)、纵坑切梢小蠹 (*Blastophagus piniperda*)、*Blitophaga undata*、蚕豆象 (*Bruchus rufimanus*)、豌豆象 (*Bruchus pisorum*)、欧洲兵豆象 (*Bruchus lentis*)、苹卷象 (*Byctiscus betulae*)、甜菜大龟甲 (*Cassida nebulosa*)、*Cerotoma trifurcata*、白菜籽龟象 (*Ceuthorrhynchus assimilis*)、芜菁龟象 (*Ceuthorrhynchus napi*)、甜菜胫跳甲 (*Chaetocnema tibialis*)、*Conoderus vespertinus*、石刁柏负泥虫 (*Crioceris asparagi*)、长角叶甲 (*Diabrotica longicornis*)、*Diabrotica 12-punctata*、玉米根叶甲 (*Diabrotica virgifera*)、墨西哥豆瓢虫 (*Epilachna varivestis*)、烟草跳甲 (*Epitrix hirtipennis*)、棉灰蒙象变种 (*Eutinobothrus brasiliensis*)、欧洲松树皮象 (*Hylobius abietis*)、埃及苜蓿叶象 (*Hypera brunneipennis*)、紫苜蓿叶象 (*Hypera postica*)、云杉八齿小蠹 (*Ips typographus*)、烟草负泥虫 (*Lema bilineata*)、黑角负泥虫 (*Lema melanopus*)、马铃薯叶甲 (*Leptinotarsa decemlineata*)、*Limonium californicum*、稻水象甲 (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、*Melanotus communis*、油菜露尾甲 (*Meligethes aeneus*)、大栗鳃金龟 (*Melolontha hippocastani*)、五月鳃金龟 (*Melolontha melolontha*)、水稻负泥虫 (*Oulema oryzae*)、葡萄黑耳喙象 (*Ortiorrhynchus sulcatus*)、草莓根象甲 (*Otiorrhynchus ovatus*)、辣根猿叶甲 (*Phaedon cochleariae*)、*Phyllotreta chrysocephala*、食叶鳃金龟属 (*Phyllophaga* sp.)、庭园发丽金龟 (*Phyllopertha horticola*)、大豆淡足跳甲 (*Phyllotreta nemorum*)、黄曲条菜跳甲 (*Phyllotreta striolata*)、日本金龟子 (*Popillia japonica*)、豌豆叶象 (*Sitona lineatus*) 和谷象 (*Sitophilus granaria*);

[0455] 双翅目昆虫 (双翅目 (Diptera)), 例如埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*)、刺扰伊蚊 (*Aedes vexans*)、墨西哥果蝇 (*Anastrepha ludens*)、五斑按蚊 (*Anopheles maculipennis*)、地中海实蝇 (*Ceratitis capitata*)、蛆症金蝇 (*Chrysomya bezziana*)、*Chrysomya hominivorax*、*Chrysomya macellaria*、高粱瘿蚊 (*Contarinia sorghicola*)、*Cordylobia anthropophaga*、尖音库蚊 (*Culex pipiens*)、瓜蝇 (*Dacus cucurbitae*)、油橄榄实蝇 (*Dacus oleae*)、油菜叶瘿蚊 (*Dasineura brassicae*)、小毛厕蝇 (*Fannia canicularis*)、马蝇 (*Gasterophilus intestinalis*)、刺舌蝇 (*Glossina morsitans*)、*Haematobia irritans*、*Haplodiplosis equestris*、花生田灰地种蝇 (*Hylemyia platura*)、纹皮蝇 (*Hypoderma lineata*)、蔬菜斑潜蝇 (*Liriomyza sativae*)、美国潜叶蝇 (*Liriomyza trifolii*)、*Lucilia caprina*、铜绿蝇 (*Lucilia cuprina*)、丝光绿蝇 (*Lucilia sericata*)、*Lycoria pectoralis*、麦瘿蚊 (*Mayetiola destructor*)、家蝇 (*Musca domestica*)、厩腐蝇 (*Muscina stabulans*)、羊狂蝇 (*Oestrus ovis*)、欧洲麦秆蝇 (*Oscinella frit*)、天仙子泉蝇 (*Pegomya hysocyami*)、*Phorbia antiqua*、萝卜蝇 (*Phorbia brassicae*)、*Phorbia coarctata*、樱桃实蝇 (*Rhagoletis cerasi*)、苹果实蝇 (*Rhagoletis pomonella*)、牛虻 (*Tabanus bovinus*)、*Tipula oleracea* 和欧洲大蚊 (*Tipula paludosa*);

[0456] 蓟马 (缨翅目 (Thysanoptera)), 例如兰花蓟马 (*Dichromothrips corbetti*)、烟

褐蓟马 (*Frankliniella fusca*)、苜蓿花蓟马 (*Frankliniella occidentalis*)、东方花蓟马 (*Frankliniella tritici*)、桔梗蓟马 (*Scirtothrips citri*)、稻蓟马 (*Thrips oryzae*)、棕榈蓟马 (*Thrips palmi*) 和烟蓟马 (*Thrips tabaci*) ;

[0457] 膜翅目昆虫 (膜翅目 (*Hymenoptera*)), 例如新疆菜叶蜂 (*Athalia rosae*)、切叶蚁 (*Atta cephalotes*)、*Atta sexdens*、*Atta texana*、*Hoplocampa minuta*、*Hoplocampa testudinea*、小黄家蚁 (*Monomorium pharaonis*)、热带火蚁 (*Solenopsis geminate*) 和红火蚁 (*Solenopsis invicta*) ;

[0458] 异翅目昆虫 (异翅目 (*Heteroptera*)), 例如拟绿蝽 (*Acrosternum hilare*)、玉米长蝽 (*Blissus leucopterus*)、黑斑烟盲蝽 (*Cyrtopeltis notatus*)、棉红蝽 (*Dysdercus cingulatus*)、*Dysdercus intermedius*、麦扁盾蝽 (*Eurygaster integriceps*)、烟草蝽 (*Euschistus impictiventris*)、棉红铃喙缘蝽 (*Leptoglossus phyllopus*)、美洲牧草盲蝽 (*Lygus lineolaris*)、牧草盲蝽 (*Lygus pratensis*)、稻绿蝽 (*Nezara viridula*)、甜菜拟网蝽 (*Piesma quadrata*)、*Solubea insularis* 和 *Thyanta perditor* ;

[0459] 同翅目昆虫 (同翅目 (*Homoptera*)), 例如 *Acyrtosiphon onobrychis*、落叶松球蚜 (*Adelges laricis*)、*Aphidula nasturtii*、甜菜蚜 (*Aphis fabae*)、草莓根蚜 (*Aphis forbesi*)、苹果蚜 (*Aphis pomi*)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)、北美茶藨子蚜 (*Aphis grossulariae*)、*Aphis schneideri*、卷叶蚜 (*Aphis spiraecola*)、*Aphis sambuci*、豌豆蚜 (*Acyrtosiphon pisum*)、马铃薯蚜 (*Aulacorthum solani*)、银叶粉虱 (*Bemisia argentifolii*)、烟粉虱 (*Bemisia tabaci*)、*Brachycaudus cardui*、杏圆尾蚜 (*Brachycaudus helichrysi*)、*Brachycaudus persicae*、*Brachycaudus prunicola*、甘蓝蚜 (*Brevicoryne brassicae*)、*Capitophorus horni*、*Cerosipha gossypii*、*Chaetosiphon fragaefolii*、*Cryptomyzus ribis*、高加索冷杉椎球蚜 (*Dreyfusia nordmannianae*)、云杉椎球蚜 (*Dreyfusia piceae*)、居根西圆尾蚜 (*Dysaphis radicola*)、*Dysaulacorthum pseudosolani*、*Dysaphis plantaginea*、*Dysaphis pyri*、蚕豆微叶蝉 (*Empoasca fabae*)、桃大尾蚜 (*Hyalopterus pruni*)、*Hyperomyzus lactucae*、麦长管蚜 (*Macrosiphum avenae*)、大戟长管蚜 (*Macrosiphum euphorbiae*)、蔷薇管蚜 (*Macrosiphon rosae*)、*Megoura viciae*、巢菜修尾蚜 (*Melanaphis pyramis*)、麦无网蚜 (*Metopolophium dirhodum*)、*Myzodes persicae*、冬葱瘤额蚜 (*Myzus ascalonicus*)、*Myzus cerasi*、桃蚜 (*Myzus persicae*)、李瘤蚜 (*Myzus varians*)、*Nasonovia ribis-nigri*、稻飞虱 (*Nilaparvata lugens*)、囊柄瘿绵蚜 (*Pemphigus bursarius*)、蔗飞虱 (*Perkinsiella saccharicida*)、忽布疣蚜 (*Phorodon humuli*)、苹木虱 (*Psylla mali*)、梨木虱 (*Psylla piri*)、冬葱瘤蛾蚜 (*Rhopalomyzus ascalonicus*)、玉米蚜 (*Rhopalosiphum maidis*)、禾谷溢管蚜 (*Rhopalosiphum padi*)、*Rhopalosiphum insertum*、*Sappaphis mala*、*Sappaphis mali*、麦二叉蚜 (*Schizaphis graminum*)、*Schizoneura lanuginosa*、麦长管蚜 (*Sitobion avenae*)、白背飞虱 (*Sogatella furcifera*)、白粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*)、*Toxoptera aurantii* 和葡萄根瘤蚜 (*Viteus vitifolii*) ;白蚁 (等翅目 (*Isoptera*)), 例如 *Caloterms flavicollis*、*Leucotermes flavipes*、黄肢散白蚁 (*Reticulitermes flavipes*)、欧洲散白蚁 (*Reticulitermes lucifugus*) 和 *Termes natalensis* ;

[0460] 直翅目昆虫 (直翅目 (*Orthoptera*)), 例如居屋艾蟋 (*Acheta domestica*)、东

方蜚蠊 (*Blatta orientalis*)、德国小蠊 (*Blattella germanica*)、欧洲球螋 (*Forficula auricularia*)、蝼蛄 (*Gryllotalpa gryllotalpa*)、飞蝗 (*Locusta migratoria*)、双纹黑蝗 (*Melanoplus bivittatus*)、红足黑蝗 (*Melanoplus femur-rubrum*)、墨西哥黑蝗 (*Melanoplus mexicanus*)、迁飞黑蝗 (*Melanoplus sanguinipes*)、石栖黑蝗 (*Melanoplus spretus*)、条纹红蝗 (*Nomadacris septemfasciata*)、美洲蟑螂 (*Periplaneta americana*)、美洲沙漠蝗 (*Schistocerca americana*)、*Schistocerca peregrina*、*Stauronotus maroccanus* 和庭疾灶螽 (*Tachycines asynamorus*)，

[0461] 蜘蛛纲 (*Arachnoidea*)，如蜘蛛 (蜱螨目 (*Acarina*))，例如软蜱科 (*Argasidae*)、硬蜱科 (*Ixodidae*) 和疥螨科 (*Sarcoptidae*)，如长星形壁虱 (*Amblyomma americanum*)、热带花蜱 (*Amblyomma variegatum*)、波斯锐缘蜱 (*Argas persicus*)、牛壁虱 (*Boophilus annulatus*)、*Boophilus decoloratus*、微小牛蜱 (*Boophilus microplus*)、*Dermacentor silvarum*、*Hyalomma truncatum*、蓖子硬蜱 (*Ixodes ricinus*)、*Ixodes rubicundus*、*Ornithodoros moubata*、*Otobius megnini*、鸡皮刺螨 (*Dermanyssus gallinae*)、绵羊疥病 (*Psoroptes ovis*)、*Rhipicephalus appendiculatus*、*Rhipicephalus evertsi*、人疥螨 (*Sarcoptes scabiei*)，瘿螨属 (*Eriophyidae*)，如苹果刺锈螨 (*Aculus schlechtendali*)、*Phyllocoptrata oleivora* 和 *Eriophyes sheldoni*；细螨属 (*Tarsonemidae*)，如 *Phytonemus pallidus* 和侧多食跗线螨 (*Polyphagotarsonemus latus*)；细须螨属 (*Tenuipalpidae*)，如紫红短须螨 (*Brevipalpus phoenicis*)；叶螨属 (*Tetranychidae*)，如朱砂叶螨 (*Tetranychus cinnabarinus*)、神泽叶螨 (*Tetranychus kanzawai*)、太平洋叶螨 (*Tetranychus pacificus*)、棉叶螨 (*Tetranychus telarius*) 和二点叶螨 (*Tetranychus urticae*)，苹果叶螨 (*Panonychus ulmi*)、柑桔叶螨 (*Panonychus citri*) 和 *oligonychus pratensis*；

[0462] 蚤目 (*Siphonatera*)，例如印鼠客蚤 (*Xenopsylla cheopsis*)、角叶属 (*Ceratophyllus*)。

[0463] 组合物和式 I 或 II 化合物可用于防治线虫，尤其是植物寄生线虫如根结线虫，北方根结线虫 (*Meloidogyne hapla*)、南方根结线虫 (*Meloidogyne incognita*)、爪哇根结线虫 (*Meloidogyne javanica*) 和其他根结线虫属 (*Meloidogyne*)；形成胞囊的线虫，马铃薯金线虫 (*Globodera rostochiensis*) 和其他球胞囊属 (*Globodera*)；禾谷胞囊线虫 (*Heterodera avenae*)、大豆胞囊线虫 (*Heterodera glycines*)、甜菜胞囊线虫 (*Heterodera schachtii*)、三叶草胞囊线虫 (*Heterodera trifolii*) 和其他胞囊线虫属 (*Heterodera*)；种子肿胀线虫，粒线虫属 (*Anguina*)；茎叶线虫，滑刃线虫属 (*Aphelenchoides*)；刺线虫，杂草刺线虫 (*Belonolaimus longicaudatus*) 和其他针刺线虫属 (*Belonolaimus*)；松线虫，松材线虫 (*Bursaphelenchus xylophilus*) 和其他伞滑刃线虫属 (*Bursaphelenchus*)；环形线虫，环纹线虫属 (*Criconema*)、小环线虫属 (*Criconemella*)、轮线虫属 (*Criconemoides*)、中环线虫属 (*Mesocriconema*)；球茎线虫，腐烂茎线虫 (*Ditylenchus destructor*)、甘薯茎线虫 (*Ditylenchus dipsaci*) 和其他茎线虫属 (*Ditylenchus*)；锥线虫，锥线虫属 (*Dolichodorus*)；螺旋形线虫，*Helicotylenchus multicinctus* 和其他 *Helicotylenchus* 属；鞘线虫和鞘形 (sheathoid) 线虫，鞘线虫属 (*Hemicycliophora*) 和 *Hemicriconemoides* 属；*Hirshmanniella* 属；冠线虫，*Hoploaimus* 属；伪根结线虫，珍珠线虫属 (*Nacobbus*)；

针线虫, *Longidorus elongatus* 和其他长针线虫属 (*Longidorus*) ; 鞘线虫, 针线虫属 (*Paratylenchus*) ; 根腐线虫, *Pratylenchus neglectus*、穿刺根腐线虫 (*Pratylenchus penetrans*)、*Pratylenchus curvatus*、*Pratylenchus goodeyi* 和其他根腐线虫属 (*Pratylenchus*) ; 穿孔线虫, 香蕉穿孔线虫 (*Radopholus similis*) 和其他穿孔线虫属 (*Radopholus*) ; 肾形线虫, *Rotylenchus robustus* 和其他盘旋线虫属 (*Rotylenchus*) ; *Scutellonema* 属; 残根线虫, *Trichodorus primitivus* 和其他毛刺线虫属 (*Trichodorus*)、拟毛刺属 (*Paratrachodorus*) ; 阻长线虫, *Tylenchorhynchus claytoni*、*Tylenchorhynchus dubius* 和其他矮化线虫属 (*Tylenchorhynchus*) ; 柑桔线虫, 垫刃线虫属 (*Tylenchulus*) ; 剑线虫, 剑线虫属 (*Xiphinema*) ; 以及其他植物寄生线虫。

[0464] 在本发明的优选实施方案中, 将式 I 或 II 化合物用于防治昆虫或蜘蛛, 尤其是鳞翅目、鞘翅目、缨翅目和同翅目昆虫以及蜱螨目蜘蛛。本发明的式 I 或 II 化合物特别可以用于防治缨翅目和同翅目昆虫。

[0465] 式 I 或 II 化合物或包含它们的杀虫组合物可以通过使植物 / 作物与杀虫有效量的式 I 或 II 化合物接触而用于保护生长的植物和作物以防无脊椎动物害虫, 尤其是昆虫、螨科 (*acaridae*) 或蜘蛛侵袭或侵染。本文所用术语“作物”指生长和收获的作物二者。

[0466] 可以将式 I 或 II 化合物转化成常规配制剂, 例如溶液、乳液、悬浮液、粉剂、粉末、糊和颗粒。使用形式取决于特定的意欲目的; 在每种情况下应确保本发明化合物精细和均匀地分布。

[0467] 配制剂以已知方式制备 (对于综述例如参见 US 3,060,084, EP-A 707445 (对于液体浓缩物), Browning, “Agglomeration”, *Chemical Engineering*, 1967 年 12 月 4 日, 147-48, Perry’s *Chemical Engineer’s Handbook*, 第 4 版, McGraw-Hill, New York, 1963, 第 8-57 页及随后各页, WO 91/13546, US 4,172,714, US 4,144,050, US 3,920,442, US5,180,587, US 5,232,701, US 5,208,030, GB 2,095,558, US 3,299,566, Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, Hance 等, *Weed Control Handbook*, 第 8 版, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 和 Mollet, H., Grubemann, A., *Formulation technology*, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (德国), 2001, 2. D. A. Knowles, *Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations*, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN0-7514-0443-8), 例如通过将活性化合物与适合配制农用化学品的助剂如溶剂和 / 或载体, 需要的话乳化剂、表面活性剂和分散剂、防腐剂、消泡剂、防冻剂、用于种子处理配制剂还有任选的着色剂和 / 或粘合剂和 / 或胶凝剂混合而制备。

[0468] 合适溶剂的实例为水、芳族溶剂 (例如 Solvesso 产品、二甲苯)、石蜡 (如矿物油馏分)、醇类 (如甲醇、丁醇、戊醇、苄醇)、酮类 (如环己酮、 γ -丁内酯)、吡咯烷酮 (N-甲基吡咯烷酮 [NMP]、N-辛基吡咯烷酮 [NOP])、乙酸酯 (乙二醇二乙酸酯)、二元醇、脂肪酸二甲基酰胺、脂肪酸及脂肪酸酯。原则上还可以使用溶剂混合物。

[0469] 合适乳化剂为非离子和阴离子乳化剂 (例如聚氧乙烯脂肪醇醚、烷基磺酸盐和芳基磺酸盐)。

[0470] 分散剂的实例是木素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

[0471] 所用的合适表面活性剂是木素磺酸、萘磺酸、苯酚磺酸、二丁基萘磺酸的碱金属

盐、碱土金属盐和铵盐,烷基芳基磺酸盐,烷基硫酸盐,烷基磺酸盐,脂肪醇硫酸盐,脂肪酸和硫酸化脂肪醇乙二醇醚,还有磺化萘和萘衍生物与甲醛的缩合物,萘或萘磺酸与苯酚和甲醛的缩合物,聚氧乙烯辛基酚醚,乙氧基化的异辛基酚、辛基酚、壬基酚,烷基酚聚乙二醇醚,三丁基苯基聚乙二醇醚,三硬脂基苯基聚乙二醇醚,烷基芳基聚醚醇,醇和脂肪醇/氧化乙烯缩合物,乙氧基化蓖麻油,聚氧乙烯烷基醚,乙氧基化聚氧丙烯,月桂醇聚乙二醇醚缩醛,山梨醇酯,木素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

[0472] 适于制备可直接喷雾溶液、乳液、糊或油分散体的物质是中沸点到高沸点的矿物油馏分,如煤油或柴油,此外还有煤焦油和植物或动物来源的油,脂族、环状和芳族烃,例如甲苯、二甲苯、石蜡、四氯化萘、烷基化萘或其衍生物、甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、环己醇、环己酮、异佛尔酮,强极性溶剂,例如二甲亚砜、N-甲基吡咯烷酮或水。

[0473] 还可以将防冻剂如甘油、乙二醇、丙二醇和杀菌剂加入配制剂中。

[0474] 合适的消泡剂例如为基于硅或硬脂酸镁的消泡剂。

[0475] 合适的防腐剂例如为二氯芬。

[0476] 种子处理配制剂可以额外包含粘合剂和任选的着色剂。

[0477] 可以加入粘合剂以改进处理之后活性物质在种子上的粘附。合适的粘合剂是嵌段共聚物、EO/PO 表面活性剂以及聚乙烯醇、聚乙烯基吡咯烷酮、聚丙烯酸酯、聚甲基丙烯酸酯、聚丁烯、聚异丁烯、聚苯乙烯、聚乙烯胺、聚乙烯酰胺、聚乙烯亚胺 (**Lupasol[®]**、**Polymin[®]**)、聚醚、聚氨酯、聚乙酸乙烯酯、纤基乙酸钠以及衍生于这些聚合物的共聚物。

[0478] 任选还可以在配制剂中包括着色剂。对种子处理配制剂合适的着色剂或染料是若丹明 B、C. I. 颜料红 112、C. I. 溶剂红 1、颜料蓝 15:4、颜料蓝 15:3、颜料蓝 15:2、颜料蓝 15:1、颜料蓝 80、颜料黄 1、颜料黄 13、颜料红 112、颜料红 48:2、颜料红 48:1、颜料红 57:1、颜料红 53:1、颜料橙 43、颜料橙 34、颜料橙 5、颜料绿 36、颜料绿 7、颜料白 6、颜料棕 25、碱性紫 10、碱性紫 49、酸性红 51、酸性红 52、酸性红 14、酸性蓝 9、酸性黄 23、碱性红 10、碱性红 108。

[0479] 胶凝剂的实例是角叉菜(**Satiagel[®]**)。

[0480] 粉末、撒播用材料和可撒粉产品可以通过将活性物质与固体载体混合或同时研磨而制备。

[0481] 颗粒如涂覆颗粒、浸渍颗粒和均质颗粒可以通过将活性化合物与固体载体粘附而制备。

[0482] 固体载体的实例是矿土如硅胶、硅酸盐、滑石、高岭土、活性粘土 (attaclay)、石灰石、石灰、白垩、红玄武土、黄土、粘土、白云石、硅藻土、硫酸钙、硫酸镁、氧化镁;磨碎的合成材料;肥料如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、脲类;植物来源的产品如谷粉、树皮粉、木粉和坚果壳粉,纤维素粉和其他固体载体。

[0483] 配制剂通常包含 0.01-95 重量%,优选 0.1-90 重量%活性化合物。此时,活性化合物以 90-100 重量%,优选 95-100 重量%的纯度(根据 NMR 光谱)使用。

[0484] 对于种子处理目的,相应配制剂可以稀释 2-10 倍,从而在即用制剂中得到 0.01-60 重量%,优选 0.1-40 重量%的活性化合物浓度。

[0485] 式 I 或 II 化合物可以直接、以其配制剂形式或由其制备的使用形式（如可直接喷雾溶液、粉末、悬浮液或分散体、乳液、油分散体、糊、可撒粉产品、撒播用材料或颗粒形式），借助喷雾、雾化、撒粉、撒播或浇灌来使用。使用形式完全取决于意欲的目的；在任何情况下意欲确保本发明活性化合物的最佳可能分布。

[0486] 含水使用形式可通过加入水由乳液浓缩物、糊或可湿性粉末（可喷雾粉末、油分散体）制备。为制备乳液、糊或油分散体，可借助润湿剂、增粘剂、分散剂或乳化剂将该物质直接或溶于油或溶剂中后在水中均化。然而，还可以制备由活性物质、润湿剂、增粘剂、分散剂或乳化剂以及合适的话溶剂或油组成的浓缩物且该浓缩物适于用水稀释。

[0487] 即用制剂中的活性化合物浓度可在较宽范围内变化。它们通常为 0.0001-10 重量%，优选 0.01-1 重量%。

[0488] 活性化合物也可成功用于超低容量法 (ULV)，其中可以施用包含超过 95 重量% 活性化合物的配制剂，或甚至施用不含添加剂的活性化合物。

[0489] 下列为配制剂实例：

[0490] 1. 叶面施用的用水稀释的产品。对于种子处理目的，该产品可以稀释或不加稀释地施用于种子。

[0491] A) 水溶性浓缩物 (SL、LS)

[0492] 将 10 重量份活性化合物溶于 90 重量份水或水溶性溶剂中。或者，加入润湿剂或其他助剂。活性化合物经水稀释溶解，从而得到含 10 重量% 活性化合物的配制剂。

[0493] B) 分散性浓缩物 (DC)

[0494] 将 20 重量份活性化合物溶于 70 重量份环己酮中并加入 10 重量份分散剂如聚乙烯吡咯烷酮。用水稀释得到分散体，从而得到含有 20 重量% 活性化合物的配制剂。

[0495] C) 可乳化浓缩物 (EC)

[0496] 将 15 重量份活性化合物溶于 7 重量份二甲苯中并加入十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物（在每种情况下为 5 重量份）。用水稀释得到乳液，从而得到含有 15 重量% 活性化合物的配制剂。

[0497] D) 乳液 (EW、EO、ES)

[0498] 将 25 重量份活性化合物溶于 35 重量份二甲苯中并加入十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物（在每种情况下为 5 重量份）。借助乳化机（例如 Ultraturrax）将该混合物引入 30 重量份水中并制成均相乳液。用水稀释得到乳液，从而得到含有 25 重量% 活性化合物的配制剂。

[0499] E) 悬浮液 (SC、OD、FS)

[0500] 在搅拌的球磨机中，将 20 重量份活性化合物粉碎并加入 10 重量份分散剂、润湿剂和 70 重量份水或有机溶剂，得到细碎活性化合物悬浮液。用水稀释得到稳定的活性化合物悬浮液，从而得到含有 20 重量% 活性化合物的配制剂。

[0501] F) 水分散性颗粒和水溶性颗粒 (WG、SG)

[0502] 将 50 重量份活性化合物细碎研磨并加入 50 重量份分散剂和润湿剂，借助工业装置（如挤出机、喷雾塔、流化床）将其制成水分散性或水溶性颗粒。用水稀释得到稳定的活性化合物分散体或溶液，从而得到含有 50 重量% 活性化合物的配制剂。

[0503] G) 水分散性粉末和水溶性粉末 (WP、SP、SS、WS)

[0504] 将 75 重量份活性化合物在转子-定子磨机中研磨并加入 25 重量份分散剂、润湿剂和硅胶。用水稀释得到稳定的活性化合物分散体或溶液,从而得到含有 75 重量%活性化合物的配制剂。

[0505] H) 凝胶配制剂 (GF)

[0506] 在搅拌的球磨机中将 20 重量份活性化合物研磨,加入 10 重量份分散剂、1 重量份胶凝剂润湿剂和 70 重量份水或有机溶剂,得到细活性化合物悬浮液。用水稀释得到活性化合物的稳定悬浮液,从而得到活性化合物含量为 20 重量%的配制剂。

[0507] 2. 叶面施用的不经稀释而施用的产品。对于种子处理目的,该产品可以稀释或不加稀释地施用于种子。

[0508] I) 可撒粉粉末 (DP、DS)

[0509] 将 5 重量份活性化合物细碎研磨并与 95 重量份细碎高岭土充分混合。这得到含有 5 重量%活性化合物的可撒粉产品。

[0510] J) 颗粒 (GR、FG、GG、MG)

[0511] 将 0.5 重量份活性化合物细碎研磨并结合 95.5 重量份载体,从而得到含有 0.5 重量%活性化合物的配制剂。现行方法是挤出、喷雾干燥或流化床方法。这得到叶面使用的不经稀释而施用的颗粒。

[0512] K) ULV 溶液 (UL)

[0513] 将 10 重量份活性化合物溶于 90 重量份有机溶剂如二甲苯中。这得到含有 10 重量%活性化合物的产品,其不经稀释而施用于叶面。

[0514] 式 I 或 II 化合物还适合处理植物繁殖材料(如种子)。常规的种子处理配制剂包括例如可流动浓缩物 FS、溶液 LS、干处理用粉末 DS、淤浆处理用水分散性粉末 WS、水溶性粉末 SS 以及乳液 ES 和 EC 和凝胶配制剂 GF。这些配制剂可以经稀释或不经稀释地施用于种子。施用于种子在播种之前直接对种子或在后者预萌发之后进行。

[0515] 在优选实施方案中,将 FS 配制剂用于种子处理。FS 配制剂通常可以包含 1-800g/1 活性成分,1-200g/1 表面活性剂,0-200g/1 防冻剂,0-400g/1 粘合剂,0-200g/1 颜料和至多 1 升溶剂,优选水。

[0516] 用于种子处理的式 I 或 II 化合物的其他优选 FS 配制剂包含 0.5-80 重量%活性成分,0.05-5 重量%润湿剂,0.5-15 重量%分散剂,0.1-5 重量%增稠剂,5-20 重量%防冻剂,0.1-2 重量%消泡剂,1-20 重量%颜料和/或染料,0-15 重量%粘着剂/粘附剂,0-75 重量%填料/赋形剂和 0.01-1 重量%防腐剂。

[0517] 各种类型的油、润湿剂、辅助剂、除草剂、杀真菌剂、其他杀虫剂或杀菌剂都可加入活性成分中,若合适的话,恰在紧临使用前加入(桶混合)。这些试剂通常与本发明试剂以 1:10-10:1 的重量比混合。

[0518] 式 I 或 II 化合物通过接触(经由土壤、玻璃、墙壁、床网、地毯、植物部分或动物部分)和摄取(诱饵或植物部分)而有效。

[0519] 为了用于蚂蚁、白蚁、黄蜂、蝇、蚊子、蟋蟀或蟑螂,优选将式 I 或 II 化合物用于诱饵组合中。

[0520] 诱饵可以是液体、固体或半固体制剂(例如凝胶)。固体诱饵可以制成各种适合相应应用的形状和形式,如颗粒、块、棒、片。液体诱饵可以填充到各种装置中以确保适当施

用,例如敞开容器、喷雾装置、液滴供应源或蒸发源。凝胶可以基于含水基质或油性基质且可以按照粘性、水分保留或老化特性根据特定要求配制。

[0521] 用于组合物中的诱饵是具有足够的吸引力以刺激诸如蚂蚁、白蚁、黄蜂、蝇、蚊子、蟋蟀等的昆虫或蟑螂食用它的产品。吸引力可以通过使用进食刺激剂或性信息素调控。食物刺激剂例如并不穷举地选自动物和 / 或植物蛋白质 (肉 -、鱼 - 或血液膳食,昆虫部分、蛋黄)、动物和 / 或植物来源的脂肪和油或单 -、低聚 - 或聚有机糖类,尤其是蔗糖、乳糖、果糖、右旋糖、葡萄糖、淀粉、果胶或甚至糖蜜或蜂蜜。水果、作物、植物、动物、昆虫的新鲜或腐败部分或其特定部分也可以用作进食刺激剂。已知性信息素更具昆虫特异性。特殊信息素描述于文献中并且对本领域熟练技术人员是已知的。

[0522] 式 I 或 II 化合物的配制剂如气雾剂 (例如在喷雾罐中)、油喷雾剂或泵喷雾剂高度适于非专业使用者来防治害虫如蝇、跳蚤、蜚、蚊子或蟑螂。气雾剂配方优选由如下组分组成:活性化合物;溶剂如低级醇 (例如甲醇、乙醇、丙醇、丁醇),酮类 (例如丙酮、甲基乙基酮),沸程为约 50-250° C 的链烷烃 (例如煤油),二甲基甲酰胺,N- 甲基吡咯烷酮,二甲亚砜,芳族烃类如甲苯、二甲苯,水;此外还有助剂,例如乳化剂如山梨糖醇单油酸酯、具有 3-7mol 氧化乙烯的油基乙氧基化物、脂肪醇乙氧基化物,芳香油如精油,中等脂肪酸与低级醇的酯,芳族羰基化合物;合适的话还有稳定剂如苯甲酸钠,两性表面活性剂,低级环氧化物,原甲酸三乙酯和需要的话推进剂如丙烷、丁烷、氮气、压缩空气、二甲醚、二氧化碳、氧化亚氮或这些气体的混合物。

[0523] 油喷雾配制剂与气雾剂配方的不同在于没有使用推进剂。

[0524] 式 I 或 II 化合物及其相应的组合物还可以用于蚊香片和熏蒸片,发烟盒、蒸发器板或长效蒸发器以及扑蛾纸、扑蛾垫或其他与热无关的蒸发器体系中。

[0525] 用式 I 或 II 化合物及其相应组合物控制由昆虫传递的传染性疾病 (例如疟疾、登革热和黄热病,淋巴丝虫病以及利什曼病) 的方法也包括处理棚屋和房子的表面、空气喷雾和浸渍窗帘、帐篷、衣物、床品、采采蝇网等。施用于纤维、织物、编织物、无纺布、网状材料或箔以及篷布上的杀虫组合物优选包含包括杀虫剂、任选的驱除剂和至少一种粘合剂的混合物。合适的驱除剂例如为 N,N- 二乙基 - 间甲苯甲酰胺 (DEET), N,N- 二乙基苯基乙酰胺 (DEPA), 1-(3- 环己烷 -1- 基羰基) -2- 甲基哌啶, (2- 羟基甲基环己基) 乙酸内酯, 2- 乙基 -1, 3- 己二醇, 避虫酮, 甲基新癸酰胺 (MNDA), 不用于昆虫防治的拟除虫菊酯如 {(+/-)-3- 烯丙基 -2- 甲基 -4- 氧代环戊 -2-(+)- 烯基 -(+)- 反式 - 菊酸酯 (Esbiothrin), 衍生于植物提取物或与植物提取物相同的驱除剂如 1, 8- 萘二烯、丁子香酚、(+)-Eucamalol (1)、(-)-1- 表 -eucamalol, 或来自诸如花皮桉 (*Eucalyptus maculata*)、蔓荆 (*Vitex rotundifolia*)、Cymbopogon martinii、香茅 (*Cymbopogon citratus*) (柠檬草)、亚香茅 (*Cymbopogon nardus* (香茅)) 的植物的粗植物提取物。合适的粘合剂例如选自如下单体的聚合物和共聚物:脂族酸的乙烯基酯 (如乙酸乙烯酯和支链烷烃羧酸乙烯基酯), 醇的丙烯酸酯和甲基丙烯酸酯, 如丙烯酸丁酯、丙烯酸 2- 乙基己基酯和丙烯酸甲酯, 单烯属和二烯属不饱和烃, 如苯乙烯, 以及脂族二烯烃, 如丁二烯。

[0526] 窗帘和床品的浸渍通常通过将纺织材料浸入式 I 和 II 的活性化合物的乳液或分散体中或将它们喷雾于床品上而进行。

[0527] 可以用于处理种子的方法原则上是所有本领域已知的合适种子处理技术, 尤其是

拌种技术,如种子涂敷(例如种子压丸)、种子撒粉和种子吸液(例如种子浸泡)。这里“种子处理”指所有使种子和式 I 或 II 化合物相互接触的方法,而“拌种”指为种子提供一定量式 I 或 II 化合物的种子处理方法,即产生包含式 I 或 II 化合物的种子的方法。原则上可以在从种子收获到种子播种的任何时间对种子进行处理。种子可以在紧临种子的播种之前或在其中处理,例如使用“播种箱”方法。然而,还可以在播种之前几个星期或几个月,例如播种之前至多 12 个月进行处理,例如以拌种处理形式进行,此时没有观察到效力显著降低。

[0528] 有利的是,对未播种的种子进行处理。本文所用术语“未播种的种子”意欲包括从种子收获到为萌发和植物生长的目的而在地中播种种子的任何时间段的种子。

[0529] 具体而言,在处理中采取如下程序:在合适的装置如用于固体或固体/液体混合配对的混合装置中将种子与所需量的种子处理配制剂直接或在预先用水稀释之后混合,直到组合物均匀分布于种子上。合适的话,然后进行干燥步骤。

[0530] 式 I 或 II 化合物或其对映体、非对映体或可兽用盐尤其还适合用于在动物上防除寄生虫。

[0531] 因此,本发明的另一目的是提供在动物中和动物上防治寄生虫的新方法。本发明的另一目的是提供对动物更安全的杀虫剂。本发明的另一目的进一步在于提供可以与现有杀虫剂相比以更低剂量使用的动物用杀虫剂。本发明的另一目的是提供对寄生虫提供长的残留防治的动物用杀虫剂。

[0532] 本发明还涉及用于在动物中和动物上防除寄生虫的含有杀寄生虫有效量的式 I 或 II 化合物或其对映体或可兽用盐和可接受的载体的组合物。

[0533] 本发明还提供了一种处理、防治、预防和保护动物以免受寄生虫侵染和感染的方法,该方法包括对动物口服、局部或肠胃外给药或施用杀寄生虫有效量的式 I 或 II 化合物或其对映体或可兽用盐和可接受的载体或包含它的组合物。

[0534] 本发明还提供了一种处理、防治、预防和保护动物以免受寄生虫侵染和感染的非治疗方法,该方法包括对其场所 -P 施用杀寄生虫有效量的式 I 或 II 化合物或其对映体或可兽用盐和可接受的载体或包含它的组合物。

[0535] 本发明还提供了一种制备用于处理、防治、预防或保护动物以免受体外寄生虫侵染或感染的组合物的方法,该方法包括将杀寄生虫有效量的式 I 或 II 化合物或其对映体或可兽用盐和可接受的载体或包含它的组合物引入。

[0536] 本发明进一步涉及式 I 化合物在处理、防治、预防或保护动物以免受寄生虫侵染或感染中的用途。

[0537] 本发明还涉及式 I 或 II 化合物或其对映体或可兽用盐和可接受载体或包含它的组合物在制造用于治疗性处理动物以免受寄生虫侵染或感染的药物中的用途。

[0538] 化合物对抗农业害虫的活性并不意味着它们适合在动物中和动物上防治体内和体外寄生虫,后者要求例如在口服施用情况下的非催吐低剂量,与动物的代谢相容性,低毒性和安全处理。

[0539] 惊人的是,已发现式 I 或 II 化合物适合在动物中和动物上防治体内和体外寄生虫。式 I 或 II 化合物或其对映体或可兽用盐以及包含它们的组合物适合内吸和/或非内吸防治体外和/或体内寄生虫。它们对所有或部分发育阶段有效。

[0540] 式 I 或 II 化合物或其对映体或可兽用盐以及包含它们的组合物优选用于在包括温血动物（包括人）和鱼在内的动物中防治和预防侵染和感染。它们例如适于在哺乳动物如牛、绵羊、猪、骆驼、鹿、马、小猪、家禽、兔、山羊、狗和猫，水牛、驴、黏鹿和驯鹿，以及产皮动物如貂、丝鼠和浣熊，禽类如母鸡、鹅、火鸡和鸭以及鱼类如淡水鱼和咸水鱼如鲑鱼、鲤鱼和鳗鱼中防治和预防侵染和感染。

[0541] 式 I 或 II 化合物或其对映体或可兽用盐以及包含它们的组合物优选用于在家养动物如狗或猫中防治和预防侵染和感染。

[0542] 在温血动物和鱼类中的侵袭包括但不限于虱、咬虱、蜱、羊鼻蝇蛆、羊蜱蝇、螫蝇、家蝇、蝇、myiasitic 蝇幼虫、恙螨、蚋、蚊和蚤。

[0543] 式 I 或 II 化合物尤其可以用于防除体外寄生虫。

[0544] 式 I 化合物尤其可以用于防除体内寄生虫。

[0545] 式 I 或 II 化合物尤其可以用于分别防除下列目和属的寄生虫：蚤（蚤目 (Siphonaptera)），例如猫蚤 (*Ctenocephalides felis*)、狗蚤 (*Ctenocephalides canis*)、印鼠客蚤 (*Xenopsylla cheopis*)、致痒蚤 (*Pulex irritans*)、穿皮潜蚤 (*Tunga penetrans*) 和具带病蚤 (*Nosopsyllus fasciatus*)，蟑螂（蜚蠊目 (Blattaria)–Blattodea），例如德国小蠊 (*Blattella germanica*)、*Blattella asahinae*、美洲蟑螂 (*Periplaneta americana*)、日本大蠊 (*Periplaneta japonica*)、棕色蜚蠊 (*Periplaneta brunnea*)、*Periplaneta fuliginosa*、澳洲蜚蠊 (*Periplaneta australasiae*) 和东方蜚蠊 (*Blatta orientalis*)，

[0546] 苍蝇、蚊子（双翅目），例如埃及伊蚊、白纹伊蚊 (*Aedes albopictus*)、刺扰伊蚊、墨西哥果蝇、五斑按蚊、*Anopheles crucians*、白足按蚊 (*Anopheles albimanus*)、疟蚊 (*Anopheles Gambiae*)、*Anopheles freeborni*、白踝按蚊 (*Anopheles leucosphyrus*)、微小按蚊 (*Anopheles minimus*)、四斑按蚊 (*Anopheles quadrimaculatus*)、红头丽蝇 (*Calliphora vicina*)、蛆症金蝇、*Chrysomya hominivorax*、*Chrysomya macellaria*、鹿蝇 (*Chrysops discalis*)、*Chrysops silacea*、*Chrysops atlanticus*、*Cochliomyia hominivorax*、*Cordylobia anthropophaga*、*Culicoides furens*、尖音库蚊、斑蚊 (*Culex nigripalpus*)、致倦库蚊 (*Culex quinquefasciatus*)、媒斑蚊 (*Culex tarsalis*)、*Culiseta inornata*、*Culiseta melanura*、*Dermatobia hominis*、小毛厕蝇、马蝇、刺舌蝇、须舌蝇 (*Glossina palpalis*)、*Glossina fuscipes*、*Glossina tachinoides*、*Haematobia irritans*、*Haplodiplosis equestris*、*Hippelates* 属、纹皮蝇、*Leptoconops torrens*、*Lucilia caprina*、铜绿蝇、丝光绿蝇、*Lycoria pectoralis*、沼蚊属 (*Mansonia*)、家蝇、厩腐蝇、羊狂蝇、*Phlebotomus argentipes*、*Psorophora columbiae*、*Psorophora discolor*、*Prosimuliummixtum*、红尾肉蝇 (*Sarcophaga haemorrhoidalis*)、肉蝇属 (*Sarcophaga*)、*Simulium vittatum*、厩螫蝇 (*Stomoxys calcitrans*)、牛虻、*Tabanus atratus*、红色原虻 (*Tabanus lineola*) 和 *Tabanus similis*，

[0547] 虱（毛虱目 (Phthiraptera)），例如 *Pediculus humanus capitis*、*Pediculus humanus corporis*、阴虱 (*Phthirus pubis*)、*Haematopinus eurysternus*、*Haematopinus suis*、*Linognathus vituli*、*Bovicola bovis*、*Menopon gallinae*、*Menacanthus stramineus* 和 *Solenopotes capillatus*，

[0548] 壁虱和寄生螨（寄螨目 (Parasitiformes)）：壁虱（蜱亚目 (Ixodida)），例如

黑脚硬蜱 (*Ixodes scapularis*)、全环硬蜱 (*Ixodes holocyclus*)、太平洋硬蜱 (*Ixodes pacificus*)、棕色犬壁虱 (*Rhipicephalus sanguineus*)、安氏革螨 (*Dermacentor andersoni*)、美洲大革螨 (*Dermacentor variabilis*)、长星形壁虱 (*Amblyomma americanum*)、*Amblyomma maculatum*、*Ornithodoros hermsi*、*Ornithodoros turicata* 以及寄生螨 (甲螨亚目 (*Mesostigmata*)), 例如柏氏禽刺螨 (*Ornithonyssus bacoti*) 和鸡皮刺螨 (*Dermanyssus gallinae*) ; 辐螨亚目 (*Actinedida*) (前气门亚目 (*Prostigmata*)) 和粉螨亚目 (*Acaridida*) (无气门目 (*Astigmata*)), 例如 *Acarapis* 属、*Cheyletiella* 属、*Ornithocheyletia* 属、鼠螨属 (*Myobia*)、*Psorergates* 属、蠕形螨属 (*Demodex*)、恙螨属 (*Trombicula*)、*Listrophorus* 属、粉螨属 (*Acarus*)、食酪螨属 (*Tyrophagus*)、嗜木螨属 (*Caloglyphus*)、*Hypodectes* 属、*Pterolichus* 属、痒螨属 (*Psoroptes*)、疥螨属 (*Chorioptes*)、耳痒螨属 (*Otodectes*)、*Sarcoptes* 属、背肛螨属 (*Notoedres*)、膝螨属 (*Knemidocoptes*)、*Cytodites* 属和 *Laminosioptes* 属 ;

[0549] 臭虫 (*Heteroptera*) : 温带臭虫 (*Cimex lectularius*)、热带臭虫 (*Cimex hemipterus*)、*Reduvius senilis*、锥蝽属 (*Triatoma*)、锥蝽属 (*Rhodnius*)、*Panstrongylus* 属和 *Arilus critatus*, 虱目 (*Anoplura*), 例如 *Haematopinus* 属、*Linognathus* 属、*Pediculus* 属、*Phtirus* 属和 *Solenopotes* 属 ;

[0550] 食毛目 (*Mallophagida*) (*Arblycerina* 和 *Ischnocera* 亚目), 例如 *Trimenopon* 属、*Menopon* 属、*Trinoton* 属、*Bovicola* 属、*Werneckiella* 属、*Lepikentron* 属、*Trichodectes* 属和 *Felicola* 属 ;

[0551] 蛔虫 (*Nematoda*) :

[0552] 金针虫和 *Trichinosis* (毛管目 (*Trichosyringida*)), 例如毛形科 (*Trichinellidae*) (毛形属 (*Trichinella*))、毛首科 (*Trichuridae*) (*Trichuris* 属、毛细线虫属 (*Capillaria*)) ;

[0553] 杆形目 (*Rhabditida*), 例如小杆线虫属 (*Rhabditis*)、*Strongyloides* 属、*Helicephalobus* 属 ;

[0554] 圆线虫目 (*Strongylida*), 例如 *Strongylus* 属、*Ancylostoma* 属、美洲钩虫 (*Necator americanus*)、*Bunostomum* 属 (钩虫)、毛圆线虫属 (*Trichostrongylus*)、捻转血矛线虫 (*Haemonchus contortus*)、*Ostertagia* 属、*Cooperia* 属、细颈线虫属 (*Nematodirus*)、*Dictyocaulus* 属、*Cyathostoma* 属、结节线虫属 (*Oesophagostomum*)、猪肾虫 (*Stephanurus dentatus*)、*Ollulanus* 属、夏伯特线虫属 (*Chabertia*)、猪肾虫、气管比翼线虫 (*Syngamus trachea*)、*Ancylostoma* 属、钩虫属 (*Uncinaria*)、球首线虫属 (*Globocephalus*)、*Necator* 属、后圆线虫属 (*Metastrongylus*)、毛样缪勒线虫 (*Muellerius capillaris*)、*Protostrongylus* 属、管圆线虫属 (*Angiostrongylus*)、*Parelaphostrongylus* 属、*Aleurostrongylus abstrusus* 和肾膨结线虫 (*Dioctophyma renale*) ;

[0555] 肠线虫 (蛔目 (*Ascaridida*)), 例如似蚓蛔线虫 (*Ascaris lumbricoides*)、猪蛔虫 (*Ascaris suum*)、鸡蛔虫 (*Ascaridia galli*)、马副蛔虫 (*Parascaris equorum*)、蛲虫 (*Enterobius vermicularis*) (蛲虫)、犬弓首蛔虫 (*Toxocara canis*)、犬蛔虫 (*Toxascaris leonine*)、*Skrjabinema* 属和 *Oxyuris equi* ;

- [0556] Camallanida, 例如 *Dracunculus medinensis* (麦地那龙线虫) ;
- [0557] 旋尾目 (Spirurida), 例如 *Thelazia* 属、丝虫属 (*Wuchereria*)、*Brugia* 属、*Onchocerca* 属、*Dirofilaria* 属、*Dipetalonema* 属、*Setaria* 属、*Elaeophora* 属、狼尾旋线虫 (*Spirocerca lupi*) 和丽线虫属 (*Habronema*) ;
- [0558] 棘头虫 (棘头动物门 (Acanthocephala)), 例如 *Acanthocephalus* 属、猪巨吻棘头虫 (*Macracanthorhynchus hirudinaceus*) 和棘头虫属 (*Oncicola*) ;
- [0559] 扁虫类 (Planarians) (扁形动物门 (Plathelminthes)) ;
- [0560] 肝吸虫 (Flukes) (吸虫纲 (Trematoda)), 例如肝片形吸虫属 (*Faciola*)、*Fascioloides magna*、并殖吸虫属 (*Paragonimus*)、双腔吸虫属 (*Dicrocoelium*)、布氏姜片吸虫 (*Fasciolopsis buski*)、华枝睾吸虫 (*Clonorchis sinensis*)、血吸虫属 (*Schistosoma*)、毛毕吸虫属 (*Trichobilharzia*)、有翼翼形吸虫 (*Alaria alata*)、并殖吸虫属和 *Nanocyetes* 属 ;
- [0561] *Cercomeromorpha*, 尤其是 *Cestoda* (绦虫), 例如裂头绦虫属 (*Diphyllobothrium*)、*Tenia* 属、棘球绦虫属 (*Echinococcus*)、犬复孔绦虫 (*Dipylidium caninum*)、*Multiceps* 属、膜壳绦虫属 (*Hymenolepis*)、中殖孔绦虫属 (*Mesocestoides*)、*Vampirolepis* 属、*Moniezia* 属、*Anoplocephala* 属、*Sirometra* 属、*Anoplocephala* 属和膜壳绦虫属。
- [0562] 式 I 或 II 化合物以及包含它们的组合物尤其可用于防治双翅目、蚤目和蜚亚目的害虫。
- [0563] 此外, 尤其优选式 I 或 II 化合物以及包含它们的组合物在防除蚊子中的用途。
- [0564] 式 I 或 II 化合物以及包含它们的组合物在防除蝇中的用途是本发明的另一优选实施方案。
- [0565] 此外, 尤其优选式 I 或 II 化合物以及包含它们的组合物在防除蚤中的用途。
- [0566] 式 I 或 II 化合物以及包含它们的组合物在防除壁虱中的用途是本发明的另一优选实施方案。
- [0567] 式 I 或 II 化合物以及包含它们的组合物还尤其可以用于防治体内寄生虫 (蛔虫、棘头虫和扁虫类)。
- [0568] 式 I 或 II 化合物以及包含它们的组合物可通过接触 (经由土壤、玻璃、墙壁、床网、地毯、毡或动物部分) 和摄取 (例如诱饵) 而有效。
- [0569] 本发明涉及式 I 或 II 化合物以及包含它们的组合物在动物中和 / 或动物上防治和 / 或防除寄生虫中的治疗和非治疗用途。
- [0570] 式 I 或 II 化合物以及包含它们的组合物可以用于通过使动物与杀寄生虫有效量的式 I 或 II 化合物以及包含它们的组合物接触而保护动物免受寄生虫侵袭或侵染。
- [0571] 这里的“接触”包括直接接触 (将含有本发明式 I 或 II 化合物的杀虫混合物 / 组合物直接施用于寄生虫上, 这可以包括在其场所 -P 间接接触, 并且还任选将杀虫混合物 / 组合物直接施用于要保护的动物上) 和间接接触 (将化合物 / 组合物施用于寄生虫的场所)。通过施用于其场所而接触寄生虫为式 I 化合物的非治疗用途实例。
- [0572] 上面所定义的“场所 -P”是指动物外部的栖息地、食物供应源、繁殖地、区域、材料或寄生虫生长或可能生长的环境。本发明化合物也可以预防性地施用于预期出现害虫或寄

生虫的地方。

[0573] 式 I 化合物可以通过接触（经由土壤、玻璃、墙壁、床网、地毯、覆盖物或动物部分）和摄取（诱饵）而有效。

[0574] 给药可以预防、治疗或非治疗方式进行。

[0575] 活性化合物的给药直接或以合适的制剂形式口服、局部 / 经皮或肠胃外进行。

[0576] 通常而言，“杀寄生虫有效量”是指对生长获得可观察到的效果所需的活性成分的量，所述效果包括坏死、死亡、阻滞、预防和去除效果，破坏效果或减少目标生物体的出现和活动的效果。对于在本发明中使用的各种化合物 / 组合物，杀寄生虫有效量可以变化。组合物的杀寄生虫有效量也会根据主要条件如所需杀寄生虫效果及持续时间、目标物种、施用方式等而变化。

[0577] 通常有利的是以 0.5-100mg/kg/天，优选 1-50mg/kg/天的总量施用式 I 化合物。

[0578] 为了对温血动物口服给药，可以将式 I 或 II 化合物配制成动物饲料、动物饲料预混物、动物饲料浓缩物、丸剂、溶液、糊、悬浮液、浸液、凝胶、片剂、大丸剂和胶囊。此外，式 I 或 II 化合物可以在其饮用水中给药于动物。对于口服给药，所选择的剂型应为动物提供 0.01-100mg/kg 动物体重 / 天，优选 0.5-100mg/kg 动物体重 / 天的式 I 或 II 化合物。

[0579] 或者，式 I 或 II 化合物可以肠胃外给药于动物，例如通过腔内、肌肉、静脉内或皮下注射。式 I 或 II 化合物可以分散或溶于对于皮下注射而言生理上可接受的载体中。或者，可以将式 I 或 II 化合物配制成皮下给药用植入物。此外，式 I 或 II 化合物可以透皮给药于动物。对于肠胃外给药，所选剂型应为动物提供 0.01-100mg/kg 动物体重 / 天的式 I 或 II 化合物。

[0580] 式 I 或 II 化合物还可以浸液、粉剂、粉末、套环、挂牌 (medallions)、喷雾剂、香波、滴施 (spot-on) 和喷淋 (pour-on) 配制剂形式以及以软膏或水包油或油包水乳液局部给药于动物。对于局部施用，浸液和喷雾剂通常含有 0.5-5000ppm，优选 1-3000ppm 式 I 或 II 化合物。此外，式 I 或 II 化合物可以配制成动物，特别是四足动物如牛和绵羊用耳贴。

[0581] 合适的制剂是：

[0582] 溶液，如口服溶液、稀释后口服给药用浓缩物、用于皮肤上或用于体腔内的溶液、喷淋配制剂、凝胶；

[0583] 口服或皮肤给药乳液和悬浮液；半固体制剂；

[0584] 其中将活性化合物在软膏基质中或在水包油或油包水乳液基质中加工的配制剂；

[0585] 固体制剂如粉末、预混物或浓缩物、颗粒、丸剂、片剂、大丸剂、胶囊；气雾剂和吸入剂，以及含有活性化合物的成型制品。

[0586] 适合注射的组合物通过将活性成分溶于合适的溶剂中并任选加入其他成分如酸、碱、缓冲盐、防腐剂和加溶剂而制备。过滤这些溶液并无菌填充。

[0587] 合适的溶剂是生理上耐受的溶剂如水，链烷醇如乙醇、丁醇、苯醇、甘油、丙二醇、聚乙二醇、N-甲基吡咯烷酮、2-吡咯烷酮及其混合物。

[0588] 活性化合物可以任选溶于生理上耐受的且适合注射的植物或合成油中。

[0589] 合适的加溶剂是促进活性化合物在主溶剂中溶解或防止其沉淀的溶剂。实例是聚乙烯基吡咯烷酮、聚乙烯醇、聚氧乙基化蓖麻油和聚氧乙基化脱水山梨糖醇酯。

- [0590] 合适的防腐剂是苄醇、三氯丁醇、对羟基苯甲酸酯和正丁醇。
- [0591] 口服溶液直接给药。浓缩物在预先稀释至使用浓度之后口服给药。口服溶液和浓缩物根据上面对注射液所述的现有技术制备,并不必需无菌程序。
- [0592] 用于皮肤上的溶液滴施、涂施、擦施、洒施或喷施。
- [0593] 用于皮肤上的溶液根据现有技术以及上面对注射液所述制备,并不必需无菌程序。
- [0594] 其他合适的溶剂是聚丙二醇,苯基乙醇,苯氧基乙醇,酯类如乙酸乙酯或乙酸丁酯、苯甲酸苄基酯,醚类如亚烷基二醇烷基醚,例如二丙二醇单甲醚,酮类如丙酮、甲基乙基酮,芳族烃类,植物和合成油,二甲基甲酰胺,二甲基乙酰胺,乙二醇单乙基醚(transcutol),丙酮缩甘油(solketal),碳酸亚丙酯,以及它们的混合物。
- [0595] 可能有利的是在制备过程中加入增稠剂。合适的增稠剂是无机增稠剂如膨润土、胶态硅酸、单硬脂酸铝,有机增稠剂如纤维素衍生物、聚乙烯醇及其共聚物、丙烯酸酯和甲基丙烯酸酯。
- [0596] 将凝胶施加或涂敷在皮肤上或引入体腔中。凝胶通过用足以得到具有软膏状稠度的透明材料的增稠剂处理如在注射液情况下所述制备的溶液而制备。所用增稠剂是上面所给增稠剂。将喷淋配制剂倒在或喷雾在限定的皮肤区域,活性化合物渗透进皮肤并内吸起作用。
- [0597] 喷淋配制剂通过将活性化合物在合适的皮肤相容性溶剂或溶剂混合物中溶解、悬浮或乳化而制备。合适的话加入其他助剂如着色剂、生物吸收促进物质、抗氧化剂、光稳定剂、粘合剂。
- [0598] 合适的溶剂是水,链烷醇,二醇,聚乙二醇,聚丙二醇,甘油,芳族醇如苄醇,苯基乙醇,苯氧基乙醇,酯如乙酸乙酯,乙酸丁酯,苯甲酸苄基酯,醚如亚烷基二醇烷基醚如二丙二醇单甲基醚、二甘醇单丁基醚,酮如丙酮、甲基乙基酮,环状碳酸酯如碳酸亚丙酯、碳酸亚乙酯,芳族和 / 或脂族烃类,植物或合成油,DMF,二甲基乙酰胺,N-烷基吡咯烷酮如N-甲基吡咯烷酮、N-丁基吡咯烷酮或N-辛基吡咯烷酮、2-吡咯烷酮、2,2-二甲基-4-氧基亚甲基-1,3-二氧戊环和甘油缩甲醛。
- [0599] 合适的着色剂是所有允许用在动物上且可以溶解或悬浮的着色剂。
- [0600] 合适的吸收促进物质例如为DMSO,涂施油如肉豆蔻酸异丙基酯、二丙二醇壬酸酯、硅油及其与聚醚的共聚物,脂肪酸酯,甘油三酯,脂肪醇。
- [0601] 合适的抗氧化剂是亚硫酸盐或偏亚硫酸氢盐如偏亚硫酸氢钾、抗坏血酸、丁基羟基甲苯、丁基羟基茴香醚、生育酚。
- [0602] 合适的光稳定剂例如为2-苯基苯并咪唑-5-磺酸(novantisolic acid)。
- [0603] 合适的粘合剂例如为纤维素衍生物、淀粉衍生物、聚丙烯酸酯、天然聚合物如藻酸盐、明胶。
- [0604] 乳液可以口服、经皮给药或作为注射液给药。
- [0605] 乳液呈油包水型或水包油型。
- [0606] 它们通过将活性化合物溶于疏水性或亲水性相中并借助合适的乳化剂以及合适的话其他助剂如着色剂、吸收促进物质、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂、粘度提高物质用另一相的溶剂均化而制备。

[0607] 合适的疏水相（油）是：

[0608] 液体石蜡，硅油，天然植物油如芝麻油、杏仁油、蓖麻油，合成甘油三酯如甘油二辛酸 / 癸酸酯，含链长为 C_8 - C_{12} 的植物脂肪酸或其他具体选定的天然脂肪酸的甘油三酯混合物，可能的话还含有羟基的饱和或不饱和脂肪酸的部分甘油酯混合物， C_8 - C_{10} 脂肪酸的甘油单酯和甘油二酯，

[0609] 脂肪酸酯如硬脂酸乙基酯、己二酸二正丁基酯、月桂酸己基酯、二丙二醇壬酸酯、中等链长的支化脂肪酸与链长为 C_{16} - C_{18} 的饱和脂肪醇的酯、肉豆蔻酸异丙基酯、棕榈酸异丙基酯、链长为 C_{12} - C_{18} 的饱和脂肪醇的辛酸 / 癸酸酯、硬脂酸异丙基酯、油酸油基酯、油酸癸基酯、油酸乙基酯、乳酸乙基酯、蜡状脂肪酸酯如合成鸭尾脂腺脂肪、邻苯二甲酸二丁酯、己二酸二异丙基酯以及与后者相关的酯混合物，脂肪醇如异十三烷醇、2-辛基十二烷醇、十六烷基十八烷基醇、油醇，以及脂肪酸如油酸，和它们的混合物。

[0610] 合适的亲水相是水，醇如丙二醇、甘油、山梨醇及其混合物。

[0611] 合适的乳化剂是：

[0612] 非离子表面活性剂，例如聚乙氧基化蓖麻油、聚乙氧基化脱水山梨糖醇单油酸酯、脱水山梨糖醇单硬脂酸酯、甘油单硬脂酸酯、聚氧乙基硬脂酸酯、烷基酚聚乙二醇醚；两性表面活性剂，例如 N-月桂基对亚氨基二丙酸二钠或卵磷脂；阴离子表面活性剂，例如月桂基硫酸钠、脂肪醇醚硫酸盐、聚乙二醇单 / 二烷基醚正磷酸酯单乙醇胺盐；

[0613] 阳离子表面活性剂，如十六烷基三甲基氯化铵。

[0614] 合适的其他助剂是提高粘度并稳定乳液的物质，如羧甲基纤维素、甲基纤维素和其他纤维素以及淀粉衍生物，聚丙烯酸酯，藻酸盐，明胶，阿拉伯树胶，聚乙烯基吡咯烷酮，聚乙烯醇，甲基乙烯基醚和马来酸酐的共聚物，聚乙二醇，蜡，胶态硅酸或所述物质的混合物。

[0615] 悬浮液可以口服或局部 / 经皮给药。它们通过将活性化合物悬浮于悬浮剂中而制备，合适的话加入其他助剂如润湿剂、着色剂、生物吸收促进物质、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂。

[0616] 液态悬浮剂是所有均相溶剂和溶剂混合物。

[0617] 合适的润湿剂（分散剂）是上面所给的乳化剂。

[0618] 可以提到的其他助剂是上述那些。

[0619] 半固体制剂可以口服或局部 / 经皮给药。它们与上述悬浮液和乳液的不同仅在于它们具有更高粘度。

[0620] 为了生产固体制剂，将活性化合物与合适的赋形剂混合，合适的话加入助剂，并且制成所需剂型。

[0621] 合适的赋形剂是所有生理上耐受的固体惰性物质。所用那些是无机和有机物质。无机物质例如为氯化钠，碳酸盐如碳酸钙，碳酸氢盐，铝氧化物，二氧化钛，硅酸，泥质土，沉淀或胶态二氧化硅或磷酸盐。有机物质例如为糖类、纤维素、食品和饲料如奶粉、动物粉、谷粉和屑、淀粉。

[0622] 合适的助剂是上面所述的防腐剂、抗氧化剂和 / 或着色剂。

[0623] 其他合适的助剂是润滑剂和助滑剂如硬脂酸镁、硬脂酸、滑石、膨润土、崩解促进物质如淀粉或交联聚乙烯基吡咯烷酮、粘合剂如淀粉、明胶或线性聚乙烯基吡咯烷酮以及

干粘合剂如微晶纤维素。

[0624] 通常而言,“杀寄生虫有效量”是指对生长获得可观察到的效果所需的活性成分的量,所述效果包括坏死、死亡、阻滞、预防和去除效果,破坏效果或减少目标生物体的出现和活动的效果。对于在本发明中使用的各种化合物/组合物,杀寄生虫有效量可以变化。组合物的杀寄生虫有效量也会根据主要条件如所需杀寄生虫效果及持续时间、目标物种、施用方式等而变化。

[0625] 可以用于本发明的组合物通常可以包含约 0.001-95% 式 I 或 II 化合物。

[0626] 通常有利的是以 0.5-100mg/kg/天,优选 1-50mg/kg/天的总量施用式 I 或 II 化合物。

[0627] 即用制剂以 10 重量 ppm-80 重量%,优选 0.1-65 重量%,更优选 1-50 重量%,最优选 5-40 重量%的浓度含有对寄生虫,优选体外寄生虫起作用的化合物。

[0628] 在使用前稀释的制剂以 0.5-90 重量%,优选 1-50 重量%的浓度含有对体外寄生虫起作用的化合物。

[0629] 此外,制剂以 10 重量 ppm-2 重量%,优选 0.05-0.9 重量%,非常特别优选 0.005-0.25 重量%的浓度包含对抗体内寄生虫的式 I 或 II 化合物。

[0630] 在本发明的优选实施方案中,经皮/局部施用包含式 I 或 II 化合物的组合物。

[0631] 在另一优选实施方案中,局部施用以含有化合物的成型制品如套环、挂牌、耳贴、在身体部分上固定用的绑带以及粘合条和箔的形式进行。

[0632] 通常有利的是施用在三周内以 10-300mg/kg,优选 20-200mg/kg,最优选 25-160mg/kg 被处理动物体重的总量释放式 I 或 II 化合物的固体配制剂。

[0633] 为了制备成型制品,使用热塑性和柔性塑料以及弹性体和热塑性弹性体。合适的塑料和弹性体是与式 I 或 II 化合物充分相容的聚乙烯基树脂、聚氨酯、聚丙烯酸酯、环氧树脂、纤维素、纤维素衍生物、聚酰胺和聚酯。塑料和弹性体的详细列表以及成型制品的制备程序例如在 WO 03/086075 中给出。

[0634] 活性化合物可以单独施用或者与增效剂或对病原性体内寄生虫和体外寄生虫起作用的其他活性化合物混合施用。

[0635] 例如,式 I 的活性化合物可以与合成球虫病化合物、聚醚抗生素如安普罗铵、罗贝瓜、托曲珠利、莫能星、盐霉素、马度米星、拉沙洛西、甲基盐霉素或生度米星或与下面列举 M 中所述的其他农药混合施用。

[0636] 根据本发明使用的组合物还可以含有其他活性成分,例如其他农药、杀虫剂、除草剂、杀真菌剂、其他杀虫剂或杀菌剂,肥料如硝酸铵、尿素、钾碱和过磷酸钙,植物毒素和植物生长调节剂、安全剂和杀线虫剂。这些额外成分可以与上述组合物依次或结合使用,合适的话还在紧临使用前加入(桶混物)。例如可以在用其他活性成分处理之前或之后用本发明组合物喷雾植物。

[0637] 这些试剂可以 1:10-10:1 的重量比与本发明所用试剂混合。将作为杀虫剂使用的式 I 或 II 化合物或包含它们的组合物与其他农药混合通常导致更宽的杀虫作用谱。

[0638] 本发明化合物可以与其一起使用并且可能产生潜在的协同增效作用的下列农药 M 用来说明可能的组合,但不施加任何限制:

[0639] M. 1. 有机(硫代)磷酸酯化合物:高灭磷(acephate)、啞啞磷(azamethiphos)、

乙基谷硫磷 (azinphos-ethyl)、谷硫磷 (azinphos-methyl)、氯氧磷 (chlorethoxyfos)、毒虫畏 (chlorfenvinphos)、氯甲硫磷 (chlormephos)、毒死蜱 (chlorpyrifos)、甲基毒死蜱 (chlorpyrifos-methyl)、蝇毒磷 (coumaphos)、杀螟腈 (cyanophos)、甲基内吸磷 (demeton-S-methyl)、二嗪农 (diazinon)、敌敌畏 (dichlorvos/DDVP)、百治磷 (dicrotophos)、乐果 (dimethoate)、甲基毒虫畏 (dimethylvinphos)、乙拌磷 (disulfoton)、EPN、乙硫磷 (ethion)、丙线磷 (ethoprophos)、伐灭磷 (famphur)、苯线磷 (fenamiphos)、杀螟松 (fenitrothion)、倍硫磷 (fenthion)、吡氟硫磷 (flupyrazophos)、噻唑硫磷 (fosthiazate)、庚烯磷 (heptenophos)、异噁唑磷 (isoxathion)、马拉硫磷 (malathion)、灭蚜磷 (mecarbam)、甲胺磷 (methamidophos)、杀扑磷 (methidathion)、速灭磷 (mevinphos)、久效磷 (monocrotophos)、二溴磷 (naled)、氧乐果 (omethoate)、砒吸磷 (oxydemeton-methyl)、一六零五 (parathion)、甲基对硫磷 (parathion-methyl)、稻丰散 (phenthoate)、甲拌磷 (phorate)、伏杀磷 (phosalone)、亚胺硫磷 (phosmet)、磷胺 (phosphamidon)、辛硫磷 (phoxim)、虫螨磷 (pirimiphos-methyl)、丙溴磷 (profenofos)、巴胺磷 (propetamphos)、丙硫磷 (prothiofos)、吡唑硫磷 (pyraclofos)、吡啶硫磷 (pyridaphenthion)、喹硫磷 (quinalphos)、治螟磷 (sulfotep)、丁基嘧啶磷 (tebupirimfos)、双硫磷 (temephos)、特丁磷 (terbufos)、杀虫威 (tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷 (thiometon)、三唑磷 (triazophos)、敌百虫 (trichlorfon)、蚜灭磷 (vamidothion)；

[0640] M. 2. 氨基甲酸酯化合物：涕灭威 (aldicarb)、棉铃威 (alanycarb)、噁虫威 (bendiocarb)、丙硫克百威 (benfuracarb)、丁酮威 (butocarboxim)、丁酮氧威 (butoxycarboxim)、甲萘威 (carbaryl)、虫螨威 (carbofuran)、丁硫克百威 (carbosulfan)、苯虫威 (ethiofencarb)、仲丁威 (fenobucarb)、抗螨脒 (formetanate)、呋线威 (furathiocarb)、异丙威 (isoprocarb)、灭虫威 (methiocarb)、灭多虫 (methomyl)、速灭威 (metolcarb)、甲氧叉威 (oxamyl)、抗蚜威 (pirimicarb)、残杀威 (propoxur)、硫双威 (thiodicarb)、久效威 (thiofanox)、混杀威 (trimethacarb)、XMC、灭杀威 (xylylcarb)、唑蚜威 (triazamate)；

[0641] M. 3. 合成除虫菊酯化合物：氟丙菊酯 (acrinathrin)、丙烯除虫菊 (allethrin)、右旋丙烯菊酯 (d-cis-trans allethrin)、右旋反式丙烯菊酯 (d-trans allethrin)、氟氯菊酯 (bifenthrin)、生物烯丙菊酯 (bioallethrin)、2-环戊烯基生物烯丙菊酯 (bioallethrin S-cyclopentenyl)、生物苄呋菊酯 (bioresmethrin)、乙氰菊酯 (cycloprothrin)、氟氯氰菊酯 (cyfluthrin)、高效氟氯氰菊酯 (beta-cyfluthrin)、(RS) 氯氟氰菊酯 (cyhalothrin)、氯氟氰菊酯 (lambda-cyhalothrin)、精高效氯氟氰菊酯 (gamma-cyhalothrin)、氯氰菊酯 (cypermethrin)、甲体氯氰菊酯 (alpha-cypermethrin)、乙体氯氰菊酯 (beta-cypermethrin)、高效反式氯氰菊酯 (theta-cypermethrin)、己体氯氰菊酯 (zeta-cypermethrin)、苯醚氰菊酯 (cyphenothrin)、溴氰菊酯 (deltamethrin)、烯炔菊酯 (empenthrin)、高氰戊菊酯 (esfenvalerate)、醚菊酯 (etofenprox)、甲氰菊酯 (fenproprathrin)、杀灭菊酯 (fenvalerate)、氟氰戊菊酯 (flucythrinate)、氟氯苯菊酯 (flumethrin)、氟胺氰菊酯 (tau-fluvalinate)、溴氟醚菊酯 (halfenprox)、咪炔菊酯 (imiprothrin)、甲氧苄氟菊酯 (metofluthrin)、氯菊酯 (permethrin)、苯

醚菊酯 (phenothrin)、炔酮菊酯 (prallethrin)、丙氟菊酯 (profluthrin)、除虫菊酯 (pyrethrin(除虫菊 (pyrethrum)))、灭虫菊 (resmethrin)、灭虫硅醚 (silaflofen)、七氟菊酯 (tefluthrin)、胺菊酯 (tetramethrin)、四溴菊酯 (tralomethrin)、四氟菊酯 (transfluthrin) ;

[0642] M. 4. 保幼激素模拟物 : 蒙 512 (hydroprene)、烯虫炔酯 (kinoprene)、蒙五一五 (methoprene)、双氧威 (fenoxycarb)、蚊蝇醚 (pyriproxyfen) ;

[0643] M. 5. 烟酸受体激动剂 / 拮抗剂化合物 : 吡虫清 (acetamiprid)、杀虫磺 (bensultap)、杀螟丹 (cartap hydrochloride)、噻虫胺 (clothianidin)、呋虫胺 (dinotefuran)、吡虫啉 (imidacloprid)、噻虫嗪 (thiamethoxam)、硝胺烯啶 (nitenpyram)、烟碱 (nicotine)、艾克敌 105 (spinosad) (别构激动剂)、乙基多杀菌素 (spinetoram) (别构激动剂)、噻虫啉 (thiacloprid)、杀虫环 (thiocyclam)、杀虫双 (thiosultap-sodium) 和 AKD 1022 ;

[0644] M. 6. GABA 门控氯离子通道拮抗剂化合物 : 氯丹 (chlordane)、硫丹 (endosulfan)、林丹 (gamma-HCH(lindane))、乙虫腈 (ethiprole)、锐劲特 (fipronil)、pyrafluprole、pyriprole ;

[0645] M. 7. 氯离子通道活化剂 : 齐墩螨素 (abamectin)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐 (emamectin benzoate)、米尔螨素 (milbemectin)、lepimectin ;

[0646] M. 8. METI I 化合物 : 啞螨醚 (fenazaquin)、啞螨酯 (fenpyroximate)、啞螨醚 (pyrimidifen)、啞螨酮 (pyridaben)、吡啶胺 (tebufenpyrad)、啞虫酰胺 (tolfenpyrad)、啞虫胺 (flufenimer)、鱼藤酮 (rotenone) ;

[0647] M. 9. METI II 和 III 化合物 : 灭螨醌 (acequinocyl)、fluacyprim、灭蚁脞 (hydramethylnon) ;

[0648] M. 10. 氧化磷酸化去偶剂 : 氟啞虫清 (chlorfenapyr)、二硝酚 (DNOC) ;

[0649] M. 11. 氧化磷酸化抑制剂 : 三唑锡 (azocyclotin)、三环锡 (cyhexatin)、杀螨硫隆 (diafenthiuron)、杀螨锡 (fenbutatin oxide)、克螨特 (propargite)、三氯杀螨砜 (tetradifon) ;

[0650] M. 12. 蜕皮干扰剂 : 灭蝇胺 (cyromazine)、环虫酰肼 (chromafenozide)、特丁苯酰肼 (halofenozide)、甲氧苯酰肼 (methoxyfenozide)、双苯酰肼 (tebufenozide) ;

[0651] M. 13. 增效剂 : 增效醚 (piperonyl butoxide)、脱叶磷 (tribufos) ;

[0652] M. 14. 钠通道阻断剂化合物 : 噁二唑虫 (indoxacarb)、氰氟虫胺 (metaflumizone) ;

[0653] M. 15. 熏蒸剂 : 溴甲烷 (methyl bromide)、氯化苦 (chloropicrin)、磺酰氟 (sulfuryl fluoride) ;

[0654] M. 16. 选择性进食阻断剂 : crylotie、拒嗉酮 (pymetrozine)、氟啞虫酰胺 (flonicamid) ;

[0655] M. 17. 螨生长抑制剂 : 四螨嗪 (clofentezine)、噻螨酮 (hexythiazox)、特苯噁唑 (etoxazole) ;

[0656] M. 18. 几丁质合成抑制剂 : 噻嗪酮 (buprofezin)、双三氟虫脲 (bistrifluron)、定虫隆 (chlorfluazuron)、氟脲杀 (diflubenzuron)、氟螨脲 (flucycloxuron)、氟虫脲

(flufenoxuron)、氟铃脲 (hexaflumuron)、氟丙氧脲 (lufenuron)、双苯氟脲 (novaluron)、多氟虫酰脲 (noviflumuron)、伏虫隆 (teflubenzuron)、杀虫隆 (triflumuron) ;

[0657] M. 19. 类脂生物合成抑制剂: 螺螨酯 (spirodiclofen)、螺甲螨酯 (spiromesifen)、螺虫乙酯 (spirotetramat) ;

[0658] M. 20. 章鱼胺能激动剂 (Octapaminergic agonsits) : 双甲脒 (amitraz) ;

[0659] M. 21. 鱼尼汀 (Ryanodine) 受体调节剂: 氟虫酰胺 (flubendiamide) 和邻苯二甲酰胺化合物 (R)-、(S)-3-氯-N1-(2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基)-N2-(1-甲基-2-甲基磺酰基乙基)邻苯二甲酰胺 (M21.1) ;

[0660] M. 22. 异噁唑啉化合物: 4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氢异噁唑啉-3-基]-2-甲基-N-吡啶-2-基甲基苯甲酰胺 (M22.1)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氢异噁唑啉-3-基]-2-甲基-N-(2,2,2-三氟乙基)苯甲酰胺 (M22.2)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氢异噁唑啉-3-基]-2-甲基-N-[(2,2,2-三氟乙基氨基甲酰基)甲基]苯甲酰胺 (M22.3)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氢异噁唑啉-3-基]萘-1-甲酸[(2,2,2-三氟乙基氨基甲酰基)甲基]酰胺 (M22.4)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氢异噁唑啉-3-基]-N-[(甲氧亚氨基)甲基]-2-甲基苯甲酰胺 (M22.5)、4-[5-(3-氯-5-三氟甲基苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氢异噁唑啉-3-基]-2-甲基-N-[(2,2,2-三氟乙基氨基甲酰基)甲基]苯甲酰胺 (M22.6)、4-[5-(3-氯-5-三氟甲基苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氢异噁唑啉-3-基]萘-1-甲酸[(2,2,2-三氟乙基氨基甲酰基)甲基]酰胺 (M22.7) 和 5-[5-(3,5-二氯-4-氟苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氢异噁唑啉-3-基]-2-[1,2,4]三唑-1-基苄腈 (M22.8) ;

[0661] M. 23. 邻氨基苯甲酰胺 (Anthranilamide) 化合物: 氯虫酰胺 (chloranthraniliprole)、氰虫酰胺 (cyantraniliprole)、5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-甲酸[4-氰基-2-(1-环丙基乙基氨基甲酰基)-6-甲基苯基]酰胺 (M23.1)、5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-甲酸[2-氯-4-氰基-6-(1-环丙基乙基氨基甲酰基)苯基]酰胺 (M23.2)、5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-甲酸[2-溴-4-氰基-6-(1-环丙基乙基氨基甲酰基)苯基]酰胺 (M23.3)、5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-甲酸[2-溴-4-氯-6-(1-环丙基乙基氨基甲酰基)苯基]酰胺 (M23.4)、5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-甲酸[2,4-二氯-6-(1-环丙基乙基氨基甲酰基)苯基]酰胺 (M23.5)、5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-甲酸[4-氯-2-(1-环丙基乙基氨基甲酰基)-6-甲基苯基]酰胺 (M23.6)、N'-(2-{[5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-羰基]氨基}-5-氯-3-甲基苯甲酰基)肼甲酸甲酯 (M23.7)、N'-(2-{[5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-羰基]氨基}-5-氯-3-甲基苯甲酰基)-N'-甲基肼甲酸甲酯 (M23.8)、N'-(2-{[5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-羰基]氨基}-5-氯-3-甲基苯甲酰基)-N,N'-二甲基肼甲酸甲酯 (M23.9)、N'-(3,5-二溴-2-{[5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-羰基]氨基}苯甲酰基)肼甲酸甲酯 (M23.10)、N'-(3,5-二溴-2-{[5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-羰基]氨基}苯甲酰基)-N'-甲基肼甲酸甲酯 (M23.11) 和 N'-(3,5-二溴-2-{[5-溴-2-(3-氯吡啶-2-基)-2H-吡啶-3-羰基]氨基}苯甲酰基)肼甲酸甲酯 (M23.12) ;

基)-N,N'-二甲基胍甲酸甲酯 (M23.12) ;

[0662] M. 24. 丙二腈化合物:2-(2,2,3,3,4,4,5,5-八氟戊基)-2-(3,3,3-三氟丙基)丙二腈(CF₂HCF₂CF₂CF₂CH₂C(CN)₂CH₂CH₂CF₃) (M24.1) 和 2-(2,2,3,3,4,4,5,5-八氟戊基)-2-(3,3,4,4,4-五氟丁基)丙二腈(CF₂HCF₂CF₂CF₂CH₂C(CN)₂CH₂CH₂CF₂CF₃) (M24.2) ;

[0663] M. 25. 微生物干扰剂:苏云金芽孢杆菌以色列亚种(*Bacillus thuringiensis* subsp. *Israelensis*)、球形芽孢杆菌(*Bacillus sphaericus*)、苏云金芽孢杆菌鲑泽亚种(*Bacillus thuringiensis* subsp. *Aizawai*)、*Bacillus thuringiensis* subsp. *Kurstaki*、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种菌株(*Bacillus thuringiensis* subsp. *Tenebrionis*) ;

[0664] M. 26. 氨基咪唑酮化合物:4-[(6-溴吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)氨基}咪唑-2(5H)-酮 (M26.1)、4-[(6-氟吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)氨基}咪唑-2(5H)-酮 (M26.2)、4-[(2-氯-1,3-噻唑-5-基)甲基](2-氟乙基)氨基}咪唑-2(5H)-酮 (M26.3)、4-[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)氨基}咪唑-2(5H)-酮 (M26.4)、4-[(6-氯吡啶-3-基)甲基](2,2-二氟乙基)氨基}咪唑-2(5H)-酮 (M26.5)、4-[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](甲基)氨基}咪唑-2(5H)-酮 (M26.6)、4-[(5,6-二氯吡啶-3-基)甲基](2-氟乙基)氨基}咪唑-2(5H)-酮 (M26.7)、4-[(6-氯-5-氟吡啶-3-基)甲基](环丙基)氨基}咪唑-2(5H)-酮 (M26.8)、4-[(6-氯吡啶-3-基)甲基](环丙基)氨基}咪唑-2(5H)-酮 (M26.9) 和 4-[(6-氯吡啶-3-基)甲基](甲基)氨基}咪唑-2(5H)-酮 (M26.10) ;

[0665] M. 27. 其他各种化合物:磷化铝(aluminium phosphide)、磺胺螯酯(amidoflumet)、benclotiaz、苯螯特(benzoximate)、联苯胍酯(bifenazate)、硼砂、溴螯酯(bromopropylate)、氰化物、cyenopyrafen、丁氟螯酯(cyflumetofen)、喹菌酮(chinomethionate)、三氯杀螯醇(dicofol)、氟乙酸酯、膦、啉虫丙醚(pyridalyl)、pyrifluquinazon、硫、有机硫化合物、酒石酸氧锑钾(tartar emetic)、sulfoxaflor, N-R'-2,2-二halo-1-R''-环丙烷甲酰胺-2-(2,6-二氯- α , α , α -三氟对甲苯基)脞或N-R'-2,2-二(R''')丙酰胺-2-(2,6-二氯- α , α , α -三氟对甲苯基)脞,其中R'为甲基或乙基,halo为氯或溴,R''为氢或甲基且R'''为甲基或乙基,4-丁-2-炔基氧基-6-(3,5-二甲基哌啶-1-基)-2-氟嘧啶 (M27.1)、环丙烷乙酸1,1'-[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-4-[(2-环丙基乙酰基)氧基]甲基]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-十氢-12-羟基-4,6a,12b-三甲基-11-氧代-9-(3-吡啶基)-2H,11H-萘并[2,1-b]吡喃并[3,4-e]吡喃-3,6-二基]酯 (M27.2) 和 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 (M27.3)。

[0666] M组的市售化合物尤其可以在The Pesticide Manual,第13版,British Crop Protection Council(2003)中找到。对氧磷(Paraoxon)及其制备描述于Farm Chemicals Handbook,第88卷,Meister Publishing Company,2001中。吡氟硫磷(Flupyrzofos)描述于Pesticide Science 54,1988,第237-243页和US 4822779中。AKD 1022及其制备描述于US6300348中。M21.1由WO 2007/101540已知。异噁唑啉M22.1-M22.8例如描述于WO2005/085216,WO 2007/079162,WO 2007/026965,WO2009/126668和WO2009/051956中。邻氨基苯甲酰胺M23.1-M23.6描述于WO 2008/72743和WO 200872783

中,而那些 M23.7-M23.12 描述于 WO2007/043677 中。丙二腈类 M24.1 和 M24.2 描述于 WO 02/089579, WO02/090320, WO 02/090321, WO 04/006677, WO 05/068423, WO 05/068432 和 WO 05/063694 中。氨基呋喃酮化合物 M 26.1-M 26.10 例如描述于 WO2007/115644 中。炔基醚 M27.1 例如描述于 JP 2006131529 中。有机硫化物描述于 WO 2007060839 中。Pyripyropene 衍生物 M 27.2 描述于 WO2008/66153 和 WO 2008/108491 中。哒嗪化合物 M 27.3 描述于 JP2008/115155 中。

[0667] 本发明化合物可以与其一起使用的下列活性化合物用于说明可能的组合,但不限制它们:

[0668] F. I) 呼吸抑制剂

[0669] F. I-1) 配合物 III 在 Q_o 位点的抑制剂(例如嗜球果伞素类)嗜球果伞素类: 啞菌酯(azoxystrobin)、甲香菌酯(coumethoxystrobin)、丁香菌酯(coumoxystrobin)、醚菌胺(dimoxystrobin)、烯炔菌酯(enestroburin)、氟啞菌酯(fluxastrobin)、亚胺菌(kresoxim-methyl)、叉氨苯酰胺(metominostrobin)、炔醚菌胺(orysastrobin)、啞氧菌酯(picoxystrobin)、啞菌胺酯(pyraclostrobin)、啞胺菌酯(pyrametostrobin)、啞菌酯(pyraoxystrobin)、pyribencarb、氯啞菌酯(triclopyricarb)/chlorodincarb、炔菌酯(trifloxystrobin)、2-[2-(2,5-二甲基苯氧基甲基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯和 2-(2-(3-(2,6-二氯苯基)-1-甲基亚烯丙基氨基氧甲基)苯基)-2-甲氧亚氨基-N-甲基乙酰胺; 噁唑烷二酮类和咪唑啉酮类: 噁唑酮菌(famoxadone)、咪唑啉酮(fenamidone);

[0670] F. I-2) 配合物 II 的抑制剂(例如羧酰胺):

[0671] 羧酰苯胺类: 麦锈灵(benodanil)、bixafen、啞酰菌胺(boscalid)、羧锈灵(carboxin)、呋菌胺(fenfuram)、环酰菌胺(fenhexamid)、氟吡菌酰胺(flupyram)、氟酰胺(flutolanil)、呋吡啞灵(furametpyr)、isopyrazam、异噁菌胺(isotianil)、丙氧灭锈胺(mepropril)、氧化羧锈灵(oxycarboxin)、penflufen、吡噁菌胺(penthiopyrad)、sedaxane、叶枯酞(tecloftalam)、溴氟啞菌(thifluzamide)、噁酰菌胺(tiadinil)、2-氨基-4-甲基噁唑-5-甲酰苯胺、N-(3',4',5'-三氟联苯-2-基)-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啞-4-甲酰胺、N-(4'-三氟甲硫基联苯-2-基)-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啞-4-甲酰胺和 N-(2-(1,3,3-三甲基丁基)苯基)-1,3-二甲基-5-氟-1H-吡啞-4-甲酰胺;

[0672] F. I-3) 配合物 III 在 Q_i 位点的抑制剂: 氰霜啞(cyazofamid)、amisulbrom;

[0673] F. I-4) 其他呼吸抑制剂(配合物 I, 去偶剂) 二氟林(diflumetorim)、四氯硝基苯(tecnazen)、啞菌脞(ferimzone)、ametoctradin、硅噁菌胺(silthiofam);

[0674] 硝基苯基衍生物: 乐杀螨(binapacryl)、敌螨通(dinobuton)、敌螨普(dinocap)、氟啞胺(fluzinam)、异丙消(nitrthal-isopropyl); 有机金属化合物: 三苯锡基盐, 例如薯瘟锡(fentin acetate)、三苯锡氯(fentin chloride) 或毒菌锡(fentin hydroxide);

[0675] F. II) 甾醇生物合成抑制剂(SBI 杀真菌剂)

[0676] F. II-1) C₁₄ 去甲基化抑制剂(DMI 杀真菌剂, 例如三唑类、咪唑类) 三唑类: 戊环唑(azaconazole)、双苯三唑醇(bitertanol)、糠菌唑(bromuconazole)、环唑醇(cyproconazole)、噁醚唑(difenoconazole)、烯唑醇(diniconazole)、烯唑醇 M(diniconazole-M)、氧唑菌(epoxiconazole)、腈苯唑(fenbuconazole)、

喹唑菌酮 (fluquinconazole)、氟硅唑 (flusilazole)、粉唑醇 (flutriafol)、己唑醇 (hexaconazole)、酰胺唑 (imibenconazole)、环戊唑醇 (ipconazole)、环戊唑菌 (metconazole)、腈菌唑 (myclobutanil)、多效唑 (paclobutrazole)、戊菌唑 (penconazole)、丙环唑 (propiconazole)、丙硫菌唑 (prothioconazole)、硅氟唑 (simeconazole)、戊唑醇 (tebuconazole)、氟醚唑 (tetraconazole)、三唑酮 (triadimefon)、唑菌醇 (triadimenol)、戊叉唑菌 (triticonazole)、烯效唑 (uniconazole) ;

[0677] 咪唑类 : 抑霉唑 (imazalil)、稻瘟酯 (pefurazoate)、oxpoconazole、丙氯灵 (prochloraz)、氟菌唑 (triflumizole) ;

[0678] 嘧啶类、吡啶类和哌嗪类 : 异嘧菌醇 (fenarimol)、氟苯嘧啶醇 (nuarimol)、啉斑肟 (pyrifenox)、噻氮灵 (triforine) ;

[0679] F. II-2) δ 14- 还原酶抑制剂 (胺类, 例如吗啉类、哌啶类) 吗啉类 : 4- 十二烷基 -2, 6- 二甲基吗啉 (aldimorph)、吗菌灵 (dodemorph)、吗菌灵乙酸酯 (dodemorph acetate)、丁苯吗啉 (fenpropimorph)、克啉菌 (tridemorph) ;

[0680] 哌啶类 : 苯锈啶 (fenpropidin)、粉病灵 (piperalin) ;

[0681] 螺环菌胺类 : 螺噁茂胺 (spiroxamine) ;

[0682] F. II-3) 3- 酮基还原酶抑制剂 : 羟基酰替苯胺类 : 环酰菌胺 (fenhexamid) ;

[0683] F. III) 核酸合成抑制剂

[0684] F. III-1) RNA、DNA 合成

[0685] 苯基酰胺或酰基氨基酸杀真菌剂 : 苯霜灵 (benalaxyl)、精苯霜灵 (benalaxyl-M)、kiralaxyl、甲霜灵 (metalaxyl)、精甲霜灵 (metalaxyl-M) (mefenoxam)、甲呋酰胺 (ofurace)、噁霜灵 (oxadixyl) ; 异噁唑类和异噁唑啉酮类 : 土菌消 (hymexazole)、异噁菌酮 (octhilinone) ;

[0686] F. III-2) DNA 拓扑异构酶抑制剂 : 恶唑酸 (oxolinic acid) ;

[0687] F. III-3) 核苷酸代谢酶 (例如腺苷酸去胺酶)

[0688] 羟基 (2- 氨基) 嘧啶类 : 磺嘧菌灵 (bupirimate) ;

[0689] F. IV) 细胞分裂和 / 或细胞骨架抑制剂

[0690] F. IV-1) Tubulin 抑制剂 : 苯并咪唑类和托布津类 (thiophanate) : 苯菌灵 (benomyl)、多菌灵 (carbendazim)、麦穗宁 (fuberidazole)、涕必灵 (thiabendazole)、甲基托布津 (thiophanate methyl) ;

[0691] 三唑并嘧啶类 : 5- 氯 -7-(4- 甲基哌啶 -1- 基) -6-(2, 4, 6- 三氟苯基) -[1, 2, 4] 三唑并 [1, 5a] 嘧啶 ;

[0692] F. IV-2) 其他细胞分裂抑制剂

[0693] 苯甲酰胺类和苯基乙酰胺类 : 乙霉威 (diethofencarb)、噻唑菌胺 (ethaboxam)、戊菌隆 (pencycuron)、氟吡菌胺 (fluopicolide)、苯酰菌胺 (zoxamide) ;

[0694] F. IV-3) 肌动蛋白抑制剂 : 二苯甲酮类 : 苯菌酮 (metrafenone) ;

[0695] F. V) 氨基酸和蛋白合成抑制剂

[0696] F. V-1) 蛋氨酸合成抑制剂 (苯胺基嘧啶类)

[0697] 苯胺基嘧啶类 : 环丙嘧啶 (cyprodinil)、嘧菌胺 (mepanipyrim)、氯草定

- (nitrapyrin)、二甲嘧菌胺 (pyrimethanil) ;
- [0698] F. V-2) 蛋白合成抑制剂 (苯胺基嘧啶类)
- [0699] 抗生素类 : 灭瘟素 (blasticidin-S)、春雷素 (kasugamycin)、水合春雷素 (kasugamycin hydrochloride hydrate)、米多霉素 (mildiomycin)、链霉素 (streptomycin)、土霉素 (oxytetracyclin)、多氧霉素 (polyoxine)、井冈霉素 (validamycin A) ;
- [0700] F. VI) 信号传导抑制剂
- [0701] F. VI-1) MAP/ 组胺酸激酶抑制剂 (例如苯胺基嘧啶类) 二羧酰亚胺类 : 氟菌安 (fluoroimide)、异丙定 (iprodone)、杀菌利 (procymidone)、烯菌酮 (vinclozolin) ;
- [0702] 苯基吡咯类 : 拌种咯 (fenpiclonil)、氟噁菌 (fludioxonil) ;
- [0703] F. VI-2) G 蛋白抑制剂 : 喹啉类 : 喹氧灵 (quinoxifen) ;
- [0704] F. VII) 类脂和膜合成抑制剂 ;
- [0705] F. VII-1) 磷脂生物合成抑制剂 :
- [0706] 有机磷化合物 : 克瘟散 (edifenphos)、异稻瘟净 (iprobenfos)、定菌磷 (pyrazophos) ;
- [0707] 二硫杂戊环类 : 稻瘟灵 (isoprothiolane) ;
- [0708] F. VII-2) 类脂过氧化 : 芳族烃类 : 氯硝胺 (dicloran)、五氯硝基苯 (quintozene)、四氯硝基苯 (tecnazene)、甲基立枯磷 (tolclofos-methyl)、联苯、地茂散 (chloroneb)、氯唑灵 (etridiazole) ;
- [0709] F. VII-3) 羧酸酰胺类 (CAA 杀真菌剂) : 肉桂酸或扁桃酸酰胺 : 烯酰吗啉 (dimethomorph)、氟吗啉 (flumorph)、双炔酰菌胺 (mandiproamid)、丁吡吗啉 (pyrimorph) ;
- [0710] 缬氨酰胺氨基甲酸酯 : 苯噻菌胺 (benthiavalicarb)、异丙菌胺 (iprovalicarb)、pyribencarb、valifenalate 和 N-(1-(1-(4- 氰基苯基) 乙磺酰基) 丁 -2- 基) 氨基甲酸 (4- 氟苯基) 酯 ;
- [0711] F. VII-4) 影响细胞膜渗透性的化合物和脂肪酸氨基甲酸酯 : 百维灵 (propamocarb)、霜霉威盐酸盐 (propamocarb-hydrochlorid) ;
- [0712] F. VIII) 具有多位点作用的抑制剂
- [0713] F. VIII-1) 无机活性物质 : 波尔多液 (Bordeaux 混合物), 醋酸铜, 氢氧化铜, 王铜 (copper oxychloride), 碱式硫酸铜, 硫 ;
- [0714] F. VIII-2) 硫代 - 和二硫代氨基甲酸盐 : 福美铁 (ferbam)、代森锰锌 (mancozeb)、代森锰 (maneb)、威百亩 (metam)、磺菌威 (methasulphocarb)、代森联 (metiram)、甲基代森锌 (propineb)、福美双 (thiram)、代森锌 (zineb)、福美锌 (ziram) ;
- [0715] F. VIII-3) 有机氯化物 (例如邻苯二甲酰亚胺类、磺酰胺类、氯代腈类) : 敌菌灵 (anilazine)、百菌清 (chlorothalonil)、敌菌丹 (captafol)、克菌丹 (captan)、灭菌丹 (folpet)、抑菌灵 (dichlofluanid)、双氯酚 (dichlorophen)、磺菌胺 (flusulfamide)、六氯苯 (hexachlorobenzene)、五氯酚 (pentachlorophenole) 及其盐、四氯苯酞 (phthalide)、对甲抑菌灵 (tolylfluanid)、N-(4- 氯 -2- 硝基苯基) -N- 乙基 -4- 甲基苯磺酰胺 ;
- [0716] F. VIII-4) 胍类 : 胍、多果定 (dodine)、多果定游离碱、双胍盐 (guazatine)、

双胍辛胺 (guazatine acetate)、双胍辛醋酸盐 (iminocadine)、双胍辛胺三乙酸盐 (iminocadine triacetate)、双八胍盐 (iminocadine tris(albesilate)) ;

[0717] F. VIII-5) 葱醌类 : 二噻农 (dithianon) ;

[0718] F. IX) 细胞壁合成抑制剂

[0719] F. IX-1) 葡聚糖合成抑制剂 : 井冈霉素 (validamycin)、多氧霉素 (polyoxin B) ;

[0720] F. IX-2) 黑色素合成抑制剂 : 咯嗪酮 (pyroquilon)、三环唑 (tricyclazole)、氯环丙酰胺 (carpropamide)、双氯氰菌胺 (dicyclomet)、氰菌胺 (fenoxanil) ;

[0721] F. X) 植物防御诱导剂

[0722] F. X-1) 水杨酸路径 : 噻二唑素 (acibenzolar-S-methyl) ;

[0723] F. X-2) 其他 : 噻菌灵 (probenazole)、异噻菌胺 (isotianil)、噻酰菌胺 (tiadinil)、调环酸钙 (prohexadione-calcium) ;

[0724] 磷酸酯类 : 藻菌磷 (fosetyl)、乙磷铝 (fosetyl aluminum)、亚磷酸及其盐 ;

[0725] F. XI) 未知作用模式 : 拌棉醇 (bronopol)、灭螨蚧 (chinomethionat)、环氟菌胺 (cyflufenamid)、清菌脲 (cymoxanil)、棉隆 (dazomet)、咪菌威 (debacarb)、哒菌清 (diclomezine)、野燕枯 (difenzoquat)、野燕枯甲基硫酸酯 (difenzoquat methylsulfate)、二苯基胺、氟联苯菌 (flumetover)、磺菌胺 (flusulfamide)、flutianil、磺菌威 (methasulfocarb)、喹啉铜 (oxine-copper)、丙氧喹啉 (proquinazid)、tebufloquin、叶枯酞 (tecloftalam)、唑菌嗪 (triazoxide)、2-丁氧基-6-碘-3-丙基苯并吡喃-4-酮、N-(环丙基甲氧亚氨基-(6-二氟甲氧基-2,3-二氟苯基)甲基)-2-苯基乙酰胺、N'-(4-(4-氯-3-三氟甲基苯氧基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、N'-(4-(4-氟-3-三氟甲基苯氧基)-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、N'-(2-甲基-5-三氟甲基-4-(3-三甲基甲硅烷基丙氧基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、N'-(5-二氟甲基-2-甲基-4-(3-三甲基甲硅烷基丙氧基)苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、2-{1-[2-(5-甲基-3-三氟甲基吡唑-1-基)乙酰基]哌啶-4-基}噻唑-4-甲酸甲基-(1,2,3,4-四氢萘-1-基)酰胺、2-{1-[2-(5-甲基-3-三氟甲基吡唑-1-基)乙酰基]哌啶-4-基}噻唑-4-甲酸甲基-(R)-1,2,3,4-四氢萘-1-基酰胺、甲氧基乙酸-6-叔丁基-8-氟-2,3-二甲基喹啉-4-基酯和 N-甲基-2-{1-[2-(5-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-1-基)乙酰基]哌啶-4-基}-N-[(1R)-1,2,3,4-四氢萘-1-基]-4-噻唑甲酰胺、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基异噻唑烷-3-基]吡啶、啉菌恶唑 (pyrisoxazole)、5-氨基-2-异丙基-3-氧代-4-邻甲苯基-2,3-二氢吡唑-1-硫代甲酸 S-烯丙基酯、N-(6-甲氧基吡啶-3-基)环丙烷甲酰胺、5-氯-1-(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)-2-甲基-1H-苯并咪唑、2-(4-氯苯基)-N-[4-(3,4-二甲氧基苯基)异噻唑-5-基]-2-丙-2-炔氧基乙酰胺 ;

[0726] F. XI) 生长调节剂 : 脱落酸 (abscisic acid)、先甲草胺 (amidochlor)、嘧啶醇 (ancymidol)、苜胺基嘌呤 (6-benzylaminopurine)、油菜素内酯 (brassinolide)、地乐胺 (butralin)、矮壮素阳离子 (chlormequat) (矮壮素 (chlormequat chloride))、氯化胆碱 (choline chloride)、环丙酸酰胺 (cyclanilide)、丁酰肼 (daminozide)、敌草克 (dikegulac)、噻节因 (dimethipin)、2,6-二甲基吡啶 (2,6-dimethylpyridine)、乙烯利 (ethephon)、抑芽敏 (flumetralin)、呋啉醇 (flurprimidol)、达草氟 (fluthiacet)、调吡

脲 (forchlorfenuron)、九二〇(gibberellic acid)、抗倒胺 (inabenfide)、吡啶-3-乙酸、抑芽丹 (maleic hydrazide)、氟草磺 (mefluidide)、助壮素阳离子 (mepiquat) (助壮素 (mepiquat chloride))、萘乙酸、N-6-苄基腺嘌呤、多效唑、调环酸 (prohexadione) (调环酸钙)、茉莉酸丙酯 (prohydrojasmon)、赛二唑素 (thidiazuron)、抑芽唑 (triapenthenol)、脱叶磷 (tributyl phosphorotriethioate)、2,3,5-三碘苯甲酸、抗倒酯 (trinexapac-ethyl) 和烯效唑;

[0727] F.XII) 生物控制剂: 抗真菌生物控制剂: NRRL 号为 B-21661 的枯草芽孢杆菌 (*Bacillus substilis*) 菌株 (例如来自 AgraQuest, Inc., USA 的 **RHAPSODY®**, **SERENADE®** MAX 和 **SERENADE®** ASO), NRRL 号为 B-30087 的短小芽孢杆菌 (*Bacillus pumilus*) 菌株 (例如来自 AgraQuest, Inc., USA 的 **SONATA®**和**BALLAD®**Plus), 奥德曼细基格孢 (*Ulocladium oudemansii*) (例如来自新西兰 BotriZen Ltd. 的产品 BOTRY-ZEN), 脱乙酰壳多糖 (例如来自新西兰 BotriZen Ltd. 的 ARMOUR-ZEN)。

[0728] 无脊椎动物害虫, 即节肢动物和线虫, 植物、其中植物生长的土壤或水体可以通过本领域已知的任何施用方法与式 I 或 II 化合物或包含它们的组合物接触。这里的“接触”包括直接接触 (将化合物 / 组合物直接施用于无脊椎动物害虫或植物上, 通常施用于植物的叶、茎或根上) 和间接接触 (将化合物 / 组合物施用于无脊椎动物害虫或植物的场所)。

[0729] 此外, 无脊椎动物害虫可以通过使目标害虫, 其食物供应源、栖息地、繁殖地或其场所与杀虫有效量的式 I 或 II 化合物接触而防治。这里的施用可以在场所、生长中的作物或收获的作物被害虫侵染之前或之后进行。

[0730] “场所”通常是指栖息地、繁殖地、栽培植物、植物繁殖材料 (如种子)、土壤、区域、材料或其中害虫或寄生虫生长或可能生长的环境。

[0731] 通常而言, “杀虫有效量”是指对生长获得可观察到的效果所需的活性成分的量, 所述效果包括坏死、死亡、阻滞、预防和去除效果, 破坏效果或减少目标生物体的出现和活动的效果。对于在本发明中使用的各种化合物 / 组合物, 杀虫有效量可以变化。组合物的杀虫有效量也会根据主要条件如所需杀虫效果及持续时间、天气、目标物种、场所、施用方式等而变化。

[0732] 式 I 或 II 化合物以及包含所述化合物的组合物可以用于保护木质材料如树木、护栏、枕木等, 以及建筑物如房子、附属建筑、工厂, 还有建筑材料、家具、皮革、纤维、乙烯基制品、电线和电缆等以防蚂蚁和 / 或白蚁, 并防止蚂蚁和白蚁损害作物或人类 (例如当害虫侵入房子和公共设施时)。这些化合物不仅施用于周围的土壤表面或地板下的土壤中以保护木质材料, 而且还可以施用于堆积制品如地板下混凝土、亭柱、梁、胶合板、家具等的表面, 木质制品如碎料板、半包板 (half board) 等以及乙烯基制品如包覆的电线、乙烯基片材, 绝热材料如苯乙烯泡沫等。在防止蚂蚁损害作物或人类的施用中, 将本发明的蚂蚁防治剂施用于作物或周围土壤, 或直接施用于蚂蚁的巢穴等。

[0733] 式 I 和 II 化合物还可以预防性地施用于预期出现害虫的地方。

[0734] 式 I 或 II 化合物还可以通过使生长中的植物与杀虫有效量的式 I 或 II 化合物接触而用于保护植物免受害虫侵袭或侵染。这里的“使植物与……接触”包括直接接触 (将化合物 / 组合物直接施用于害虫和 / 或植物上, 通常施用于植物的叶、茎或根上) 和间接接

触（将化合物 / 组合物施用于害虫和 / 或植物的场所）。

[0735] 在土壤处理或施用于害虫居住地或巢穴的情况下，活性成分量为 0.0001-500g/100m²，优选 0.001-20g/100m²。

[0736] 在材料保护中的常规施用率例如为 0.01-1000g 活性化合物 /m² 被处理材料，理想的是 0.1-50g/m²。

[0737] 用于材料浸渍中的杀虫组合物通常含有 0.001-95 重量%，优选 0.1-45 重量%，更优选 1-25 重量% 至少一种驱避剂和 / 或杀虫剂。

[0738] 为了用于诱饵组合物中，活性成分的典型含量为 0.001-15 重量%，理想的是 0.001-5 重量% 活性化合物。

[0739] 为了用于喷雾组合物中，活性成分的含量为 0.001-80 重量%，优选 0.01-50 重量%，最优选 0.01-15 重量%。

[0740] 为了用于处理农作物，本发明活性成分的施用率可以为 0.1-4000g/ha，理想的是 5-600g/ha，更理想的是 10-300g/ha。

[0741] 在种子处理中，活性成分的施用率通常为 0.1g-10kg/100kg 种子，优选 1g-1kg/100kg 种子，尤其是 1-250g/100kg 种子，特别是 10-150g/100kg 种子。

[0742] 现在通过下列实施例更详细说明本发明。

[0743] I. 制备实施例

[0744] 通过适当改变原料，使用下列制备实施例中所述程序制备其他式 I 和 II 化合物。所得化合物与物理数据一起列于下表 C 中。

[0745] 产物可以由 HPLC-MS（高效液相色谱法 / 质谱法）表征。HPLC 使用在 40° C 下操作的 RP-18 分析柱（德国 Merck KgaA 的 Chromolith Speed ROD）进行。含有 0.1 体积% 三氟乙酸的乙腈 / 水混合物和 0.1 体积% 三氟乙酸用作移动相；流速：1.8ml/min 以及注入体积：2 μ l。

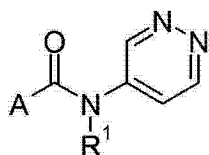
[0746] 呋喃-2-甲酸哒嗪-4-基酰胺（实施例 II. 31）

[0747] 将 2.00g (17.8mmol) 呋喃-2-甲酸悬浮于 25mL 甲苯中并将一滴二甲基甲酰胺加入该混合物中。在室温下加入 1.95ml 亚硫酸氯 (26.8mmol) 并将反应混合物在 80° C 下搅拌 2 小时。在除去溶剂之后加入甲苯并反复蒸发。然后将所得残余物溶于 5ml 二氯甲烷中并将该溶液滴加到在 20ml 二氯甲烷中含有 1.70g 哒嗪-4-基胺 (17.8mmol) 和 2.73ml 三乙胺 (19.6mmol) 的溶液中。将该混合物在室温下搅拌 2 天并用水洗涤 2 次。将有机层在 Na₂SO₄ 上干燥，过滤并在真空下除去，以褐色固体得到标题化合物 (1.9g, 54%, 95% 纯度)。

[0748] HPLC-MS :r. t. 1.146 分钟, m/z [M+H⁺] 189.9

[0749] 其中 R^t、R^u 为 H, W 为 CH, V 为 N 且 X¹ 为 O 的式 I 化合物及其盐和 N-氧化物在下文称为化合物 II. Aa :

[0750]

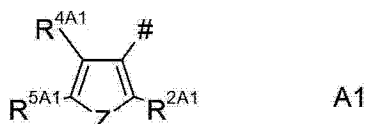


(I1.Aa)

[0751] 根据上述方法制备的式 II. Aa 化合物与其物理化学数据一起汇编在下表 C1 和 C2 中。

[0752] R^1 和 A 在每种情况下具有表 C1 的相应行所给含义, 其中 A 为:

[0753]



[0754] 表 C1 : 根据上述方法制备的其中 A 为 A1 的式 I1. Aa 化合物

[0755]

序号	Z	R^1	R^{2A1}	R^{4A1}	R^{5A1}	r. t. [min] ^{a)}	m/z ^{b)}
I. 1	S	CH ₃	H	CF ₃	H	1. 871	288. 0
I. 2	S	H	H	CF ₃	H	1. 758	274. 0
I. 3	S	CH ₃	H	H	H	1. 390	220. 0
I. 4	S	CH ₃	OCHF ₂	H	H	1. 766	286. 0
I. 5	S	CH ₃	Br	H	H	1. 852	298. 0
I. 6	S	CH ₃	Cl	H	H	1. 803	254. 0
I. 7	S	CH ₃	H	H	NO ₂	1. 661	265. 0
I. 8	S	CH ₃	Cl	H	Cl	2. 280	288. 0
I. 9	0	CH ₃	H	H	H	1. 206	204. 1
I. 10	0	CH ₃	CH ₃	H	H	1. 509	218. 1
I. 11	0	CH ₃	CF ₃	H	CH ₃	2. 300	286. 1
I. 12	0	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	1. 797	232. 1
I. 13	S	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₃	2. 367	326. 0
I. 14	S	H	H	H	H	1. 516	206. 0
I. 15	S	H	OCHF ₂	H	H	1. 815	272. 0
I. 16	S	H	Br	H	H	1. 820	283. 9
I. 17	S	H	Cl	H	H	1. 775	240. 0
I. 18	S	H	H	H	NO ₂	1. 782	251. 0
I. 19	S	H	Cl	H	Cl	2. 201	274. 0

I. 20	O	H	CH ₃	H	CH ₃	1.940	218.1
I. 21	O	H	H	H	H	1.306	190.0
I. 22	O	H	CH ₃	H	H	1.645	204.1
I. 23	S	H	Br	CH ₃	CH ₃	2.284	312.0
I. 24	O	H	CF ₃	H	CH ₃	2.290	272.0
I. 25	N-CH ₂ cPr	H	CH ₃	H	H	2.168	257.1
I. 26	N-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃	H	H	1.657	261.1
I. 27	N-iBu	H	CH ₃	H	H	2.323	259.1
I. 28	N-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃	H	Cl	2.119	295.1
I. 29	N-CH ₂ CF ₃	H	CH ₃	H	H	2.087	285.1
I. 30	N-CH ₂ CF ₃	H	CH ₃	H	Cl	2.360	319.0
I. 31	N-CH ₂ CF ₃	H	CH ₃	H	Br	2.422	363.0
I. 32	N-CH ₂ cPr	CH ₃	CH ₃	H	H	2.233	271.1
I. 33	N-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	1.680	275.1
I. 34	N-CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	2.018	299.1

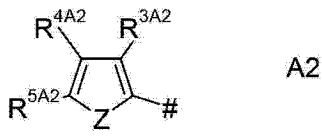
[0756]

序号	Z	R ¹	R ^{2A1}	R ^{4A1}	R ^{5A1}	r. t. [min] ^{a)}	m/z ^{b)}
I. 35	N-CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	H	Cl	2.363	333.1
I. 36	N-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	Cl	2.068	309.1
I. 37	N-iBu	CH ₃	CH ₃	H	H	2.392	273.2
I. 38	N-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	H	H	1.238	261.1
I. 39	N-CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	H	Br	2.369	377.0
I. 40	N-iBu	H	H	H	H	2.261	245.1
I. 41	N-CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	CH ₃	H	H	1.883	261.1

I. 42	N-CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	1.821	275.1
I. 43	N-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	H	H	1.460	247.1

[0757] 根据上述方法制备的其他式 I1. Aa 化合物是下表 C2 中的化合物, 其中 R¹ 和 A 在每种情况下具有表 C2 的相应行中所给含义, 其中 A 为

[0758]



[0759] 表 C2 :根据上述方法制备的其中 A 为 A2 的式 I1. Aa 化合物

[0760]

序号	Z	R ¹	R ^{3A2}	R ^{4A2}	R ^{5A2}	r. t. [min] ^{a)}	m/z ^{b)}
II. 1	S	CH ₃	CF ₃	H	H	1.976	288.0
II. 2	S	CH ₃	CH ₃	H	H	1.610	234.1
II. 3	S	H	CF ₃	H	H	1.817	274.0
II. 4	S	H	CH ₃	H	H	1.577	220.0
II. 5	S	H	Cl	H	H	1.685	240.0
II. 6	N-CH ₃	H	H	H	H	1.551	203.1
II. 7	O	CH ₃	H	H	Br	1.777	282.0
II. 8	S	CH ₃	Cl	H	H	1.807	254.0
II. 9	N-CH ₃	CH ₃	H	H	H	1.505	217.1
II. 10	O	CH ₃	H	H	H	1.233	204.1
II. 11	S	CH ₃	H	H	Cl	2.026	254.0
II. 12	S	CH ₃	H	H	H	1.455	220.0
II. 13	S	CH ₃	H	H	CH ₃	1.777	234.1
II. 14	S	CH ₃	OCH ₃	H	H	1.510	250.0
II. 15	S	CH ₃	Br	H	H	1.824	298.0
II. 16	S	CH ₃	H	H	Br	2.086	298.0

II. 17	S	CH ₃	H	H	NO ₂	1. 858	265. 0
II. 18	O	CH ₃	CH ₃	H	H	1. 540	218. 1
II. 19	S	CH ₃	H	Br	H	1. 983	298. 0
II. 20	O	H	H	H	Br	1. 683	268. 0
II. 21	O	H	H	H	NO ₂	1. 455	235. 0
II. 22	S	H	H	H	Cl	2. 092	240. 0
II. 23	S	H	H	H	H	1. 534	206. 0

[0761]

序号	Z	R ¹	R ^{3A2}	R ^{4A2}	R ^{5A2}	r. t. [min] ^{a)}	m/z ^{b)}
II. 24	S	H	H	H	CH ₃	1. 853	220. 0
II. 25	S	H	OCH ₃	H	H	1. 663	236. 0
II. 26	S	H	H	Br	H	1. 988	283. 9
II. 27	S	H	Br	H	H	1. 765	283. 9
II. 28	S	H	H	H	Br	2. 126	283. 9
II. 29	S	H	H	H	NO ₂	1. 944	251. 0
II. 30	O	H	CH ₃	H	H	1. 632	204. 1
II. 31	O	H	H	H	H	1. 146	189. 9
II. 32	N-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	H	H	1. 605	261. 1
II. 33	N-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	H	H	1. 615	247. 1
II. 34	N-iBu	H	H	H	H	2. 381	245. 1
II. 35	N-CH ₂ cPr	CH ₃	H	H	CH ₃	2. 317	271. 1
II. 36	N-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	H	CH ₃	1. 920	261. 1
II. 37	N-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	H	CH ₃	1. 917	275. 1
II. 38	N-CH ₂ cPr	H	H	H	CH ₃	2. 341	257. 1

[0762] ^{a)}r. t. = 保留时间 HPLC ^{b)}[MH]⁺ 峰 HPLC/MS

[0763] II. 杀虫活性评价：

[0764] II. 1 豇豆蚜 (豆蚜 (*Aphis craccivora*))

[0765] 将活性化合物在 50:50 (体积比) 丙酮 / 水中配制。测试溶液在使用当天制备。

[0766] 在记录害虫种群之后喷雾被 100-150 只各个阶段的蚜虫定居的盆栽豇豆植株。24、72 和 120 小时之后评价种群减少。

[0767] 在该测试中,与未处理对照相比,化合物 I. 1、I. 2、I. 3、I. 5、I. 8、I. 10、I. 11、I. 12、I. 14、I. 16、I. 17、I. 20、I. 21、I. 22、I. 24、I. 25、I. 26、I. 27、I. 28、I. 29、I. 30、I. 31、I. 32、I. 33、I. 34、I. 35、I. 36、I. 37、I. 39、I. 41、I. 42、II. 4、II. 6、II. 9、II. 11、II. 12、II. 13、II. 14、II. 16、II. 18、II. 22、II. 23、II. 24、II. 26、II. 28、II. 29、II. 30、II. 31、II. 33、II. 34、II. 36 和 II. 37 在 500ppm 下显示出至少 75% 的死亡率。

[0768] II. 2 棉蚜 (*Aphis gossypii*, 混合生命阶段)

[0769] 在环己酮中将活性化合物配制成在 1.3ml **ABgene**[®]管中供应的 10,000ppm 溶液。将这些管插入装备有雾化喷嘴的自动静电喷雾器中并作为储备溶液使用,在 50% 丙酮 :50% 水 (体积) 中由该储备溶液产生更低稀释度。非离子表面活性剂(**Kinetic**[®])以 0.01% (体积) 的量包括在该溶液中。

[0770] 在处理之前通过将来自主蚜虫群体的重度侵染的叶子置于各子叶的顶部而将子叶阶段的棉花植株用蚜虫侵染。使蚜虫经过整夜转移而实现 80-100 只蚜虫 / 植株的侵染并移走宿主叶子。然后通过装备有雾化喷嘴的自动静电植株喷雾器喷雾侵染的植株。在喷雾器通风橱中干燥各植株,从喷雾器中取出,然后在生长室中在荧光光照下于 25° C 和 20-40% 的相对湿度维持 24 小时光照期。5 天后相对于未处理对照植物上的死亡率测定被处理植株上的蚜虫死亡率。

[0771] 在该测试中,与未处理对照相比,化合物 I. 5、I. 11、I. 14、I. 17、I. 21、I. 22、I. 34、I. 35、I. 36、I. 39、I. 41、I. 43、II. 23、II. 30 和 II. 38 在 500ppm 下显示出至少 75% 的死亡率。

[0772] II. 3 银叶粉虱 (*Bemisia argentifolii*, 成虫)

[0773] 在环己酮中将活性化合物配制成在 1.3ml **ABgene**[®]管中供应的 10,000ppm 溶液。将这些管插入装备有雾化喷嘴的自动静电喷雾器中并作为储备溶液使用,在 50% 丙酮 :50% 水 (体积) 中由该储备溶液产生更低稀释度。非离子表面活性剂(**Kinetic**[®])以 0.01% (体积) 的量包括在该溶液中。

[0774] 通过装备有雾化喷嘴的自动静电植株喷雾器喷雾子叶阶段的棉花植株 (每盆一株)。在喷雾器通风橱中干燥各植株,然后由喷雾器中取出。将各盆放入塑料杯中并引入 10-12 只银叶粉虱成虫 (约 3-5 天龄)。使用抽吸装置和连接于防护移液管头的 0.6cm 无毒 **Tygon**[®]管 (R-3603) 收集昆虫。然后将含有收集的昆虫的该管头轻轻地插入含有处理植株的土壤中,使昆虫爬出该管头而到达叶面上取食。将杯子用可反复使用的筛盖 (150 微米网目的聚酯筛 PeCap, 购自 Tetko Inc) 覆盖。将测试植株在生长室中于 25° C 和 20-40% 相对湿度下保持 3 天,并避免直接暴露于荧光 (24 小时光照期) 以防止在杯内截热。在植株处理 3 天后评价与未处理对照植株相比较的死亡率。

[0775] 在该测试中,与未处理对照相比,化合物 I. 21、I. 34 和 I. 35 分别在 500ppm 下显示出至少 75% 的死亡率。

[0776] II. 4 蚕豆修尾蚜 (*Megoura viciae*)

[0777] 将活性化合物在 1:3 (体积) DMSO: 水中以不同浓度的配制化合物配制。

[0778] 将豆叶片放入填充有 0.8% 琼脂和 2.5ppm OPUS™ 的微量滴定板中。用 2.5 μL 测试溶液喷雾叶片并将 5-8 只蚜虫成虫放入微量滴定板中,然后封闭微量滴定板并在荧光下于 23±1° C 和 50±5% 相对湿度下保持 6 天。基于活的繁殖蚜虫评价死亡率。然后肉眼评价蚜虫死亡率和繁殖力。

[0779] 在该测试中,化合物 I. 2、I. 25、I. 26、I. 27、I. 28、I. 29、I. 30、I. 31、I. 32、I. 35、I. 36、I. 39、I. 41、II. 33 和 II. 37 在 2500mg/l 的测试溶液浓度下显示出至少 75% 的死亡率。

[0780] II. 5 绿桃蚜 (*Green Peach Aphid*) (*Myzus persicae*)

[0781] 为了通过内吸方式评价对绿桃蚜 (*Myzus persicae*) 的防治,测试单元由在人造膜下含有液体人工膳食的 96 孔微滴定板组成。

[0782] 使用含有 75 体积 % 水和 25 体积 % DMSO 的溶液配制化合物。使用定制微雾化器将不同浓度的配制化合物吸移于蚜虫膳食上,重复两次。在施用之后,将 5-8 只成虫蚜虫置于微滴定板孔内的人工膜上。然后使蚜虫在被处理蚜虫膳食上吮吸并在约 23±1° C 和约 50±5% 相对湿度下温育 3 天。然后肉眼评价蚜虫死亡率和繁殖力。

[0783] 在该测试中,与未处理对照相比,化合物 I. 1、I. 25、I. 26、I. 27、I. 28、I. 29、I. 30、I. 31、I. 32、I. 33、I. 34、I. 35、I. 36、I. 38、I. 39、I. 40、I. 41、I. 43、II. 32、II. 33、II. 35 和 II. 36 在 2500ppm 下显示出至少 75% 的死亡率。