



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 118955472 A

(43) 申请公布日 2024. 11. 15

(21) 申请号 202410994901.0

(22) 申请日 2016.08.04

(30) 优先权数据

15180149.5 2015.08.07 EP

(62) 分案原申请数据

201680058165.1 2016.08.04

(71) 申请人 拜耳作物科学股份公司

地址 德国莱茵河畔蒙海姆

(72) 发明人 R·菲舍尔 D·维尔基

N·考施-布希斯 D·哈格

K·伊尔格 L·霍夫梅斯特

M·维洛特 D·波兹

U·戈基恩斯 A·特伯格

(74) 专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司

11285

专利代理师 钟守期 周志明

(51) Int. Cl.

C07D 401/14 (2006.01)

C07D 471/04 (2006.01)

C07D 487/04 (2006.01)

C07D 498/04 (2006.01)

C07D 401/04 (2006.01)

C07D 235/18 (2006.01)

C07D 403/10 (2006.01)

C07D 409/10 (2006.01)

C07D 409/14 (2006.01)

C07D 491/056 (2006.01)

A01N 43/52 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

A01P 7/02 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

A01P 5/00 (2006.01)

A01P 9/00 (2006.01)

A01P 1/00 (2006.01)

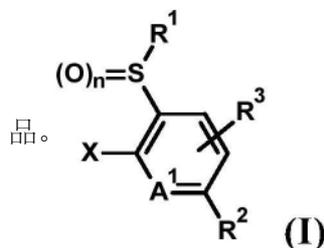
权利要求书25页 说明书181页

(54) 发明名称

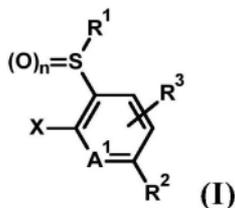
作为农药的2-(杂)芳基取代的稠合杂环衍生物

(57) 摘要

本发明涉及新的式(I)的化合物,其中R¹、R²、R³、A¹、X和n具有说明书中所述的定义;涉及其作为杀螨剂和/或杀虫剂用于防治动物害虫的用途;以及用于制备所述化合物的方法和中间体产



1. 式 (I) 的化合物



其中

A^1 表示氮、 $=N^+-O^-$ 或 $=C-R^4$,

R^1 表示 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_1-C_6) -氰基烷基、 (C_1-C_6) -羟基烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_2-C_6) -烯氧基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -卤代烯氧基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -卤代烯基、 (C_2-C_6) -氰基炔基、 (C_2-C_6) -炔基、 (C_2-C_6) -炔氧基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -卤代炔氧基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -卤代炔基、 (C_2-C_6) -氰基炔基、 (C_3-C_8) -环烷基、 (C_3-C_8) -环烷基- (C_3-C_8) -环烷基、 (C_1-C_6) -烷基- (C_3-C_8) -环烷基、卤代- (C_3-C_8) -环烷基、氨基、 (C_1-C_6) -烷基氨基、二- (C_1-C_6) -烷基氨基、 (C_3-C_8) -环烷基氨基、 (C_1-C_6) -烷基羰基氨基、 (C_1-C_6) -烷硫基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷硫基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷基亚磺酰基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基亚磺酰基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷基磺酰基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基磺酰基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基- (C_1-C_6) -烷硫基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基- (C_1-C_6) -烷基亚磺酰基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基- (C_1-C_6) -烷基磺酰基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷基羰基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基羰基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基羰基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基羰基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷基磺酰基氨基、氨基磺酰基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷基氨基磺酰基- (C_1-C_6) -烷基、二- (C_1-C_6) -烷基氨基磺酰基- (C_1-C_6) -烷基,

或表示在每种情况下任选地被相同或不同的芳基、杂芳基或杂环基取代基单取代或多取代的以下基团： (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_3-C_8) 环烷基，其中芳基、杂芳基或杂环基在每种情况下可任选地被以下相同或不同的取代基单取代或多取代：卤素、氰基、硝基、羟基、氨基、羧基、氨基甲酰基、氨基磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_8) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 卤代烷基、 (C_1-C_6) 卤代烷氧基、 (C_1-C_6) 烷硫基、 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰亚胺基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰亚胺基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰亚胺基- (C_2-C_6) 烷基羰基、 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰亚胺基、 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰亚胺基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷基亚磺酰亚胺基- (C_2-C_6) 烷基羰基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基、 (C_1-C_6) 烷基羰基、 (C_3-C_6) 三烷基甲硅烷基或苄基或

R^1 表示芳基、杂芳基或杂环基，这些基团中的每一个任选地被相同或不同的选自以下的取代基单取代或多取代：卤素、氰基、硝基、羟基、氨基、羧基、氨基甲酰基、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_8) -环烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基、 (C_1-C_6) -烷硫基、 (C_1-C_6) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) -烷基磺酰基、 (C_1-C_6) -烷基磺酰亚胺基、 (C_1-C_6) -烷基磺酰亚胺基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷基磺酰亚胺基- (C_2-C_6) -烷基羰基、 (C_1-C_6) -烷基亚磺酰亚胺基、 (C_1-C_6) -烷基亚磺酰亚胺基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷基亚磺酰亚胺基- (C_2-C_6) -烷基羰基、 (C_1-C_6) -烷氧基羰基、 (C_1-C_6) -烷基羰基、 (C_3-C_6) -三烷基甲硅烷基、 $(=O)$ (仅在杂

环基的情况下)和(=O)₂(仅在杂环基的情况下),

R²表示任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代的饱和杂环、部分饱和杂环或杂芳族环,其中至少一个碳原子被杂原子替代,其中在每种情况下任选地可存在至少一个羰基基团和/或其中可能的取代基在每种情况下为:氢、氰基、羧基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三-(C₁-C₆)烷基甲硅烷基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)卤代烷基、(C₁-C₆)氰基烷基、(C₁-C₆)羟基烷基、羟基羰基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯基、(C₂-C₆)卤代烯基、(C₂-C₆)氰基烯基、(C₂-C₆)炔基、(C₂-C₆)卤代炔基、(C₂-C₆)氰基炔基、(C₃-C₆)环烷基、(C₃-C₆)环烷基-(C₃-C₆)环烷基、(C₁-C₄)烷基-(C₃-C₆)环烷基(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)卤代烷氧基、(C₁-C₆)氰基烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基-(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基亚氨基、-N=C(H)-O(C₁-C₆)烷基、-C(H)=N-O(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)卤代烷基-(C₁-C₆)烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)卤代烷硫基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷硫基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、(C₁-C₆)卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆)烷基羰基、(C₁-C₆)卤代烷基羰基、(C₁-C₆)烷基羰基氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基、(C₁-C₆)卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆)烷基氨基羰基、二-(C₁-C₆)烷基氨基羰基、(C₂-C₆)烯基氨基羰基、二-(C₂-C₆)-烯基氨基羰基、(C₃-C₈)环烷基氨基羰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆)烷基氨基、二-(C₁-C₆)烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆)烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₆)烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰亚胺基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆)烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆)烷基氨基硫代羰基、(C₃-C₈)环烷基氨基、(C₁-C₆)烷基羰基氨基,

R²还表示选自以下的基团:-C(=O)-R⁸(G1)、-C(=S)-R⁸(G2)、-C(=O)-NR¹¹R¹²(G3)、-C(=S)-NR¹¹R¹²(G4)、-S(O)_m-R¹³(G5)、-S=O(=NH)-R¹³(G6)、-S=O(=N-CN)-R¹³(G7)、-S(=N-CN)-R¹³(G8)、-S(O)₂-NR¹¹R¹²(G9)、-NR¹¹R¹²(G10)、-NR¹¹-NR¹¹R¹²(G11)、-NR¹¹-C(=O)-R⁸(G12)、-NR¹¹-C(=S)-R⁸(G13)、-NR¹¹-S(O)₂-R¹³(G14)、-N(R¹¹)-O-R¹³(G15)、-N=S(=O)_p-R¹⁴R¹⁵(G16)、-O-R¹³(G17)、-CR¹¹=N-OR¹³(G18)或-CR¹¹=CR⁸R¹²G(19),其中如果R²表示G5、G6、G7、G8、G9,则n表示2,

R³表示氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三(C₁-C₆)烷基甲硅烷基、(C₃-C₈)环烷基、(C₃-C₈)环烷基-(C₃-C₈)环烷基、(C₁-C₆)烷基-(C₃-C₈)环烷基、卤代(C₃-C₈)环烷基、(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)卤代烷基、(C₁-C₆)氰基烷基、(C₁-C₆)羟基烷基、羟基羰基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯基、(C₂-C₆)卤代烯基、(C₂-C₆)氰基烯基、(C₂-C₆)炔基、(C₂-C₆)卤代炔基、(C₂-C₆)氰基炔基、(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)卤代烷氧基、(C₁-C₆)氰基烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基羰基-(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆)烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)烷基-(C₁-C₆)烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)卤代烷基-(C₁-C₆)烷氧基亚氨基、(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)卤代烷硫基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷硫基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基磺酰基、(C₁-C₆)卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基磺酰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆)烷基羰基、(C₁-C₆)烷基

硫代羰基、(C₁-C₆) 卤代烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、二-(C₂-C₆) -烯基氨基羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆) 烷基氨基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰亚胺基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基、NHC(=O)-(C₁-C₆) 烷基((C₁-C₆) 烷基羰基氨基)，

表示芳基或杂芳基，这些基团中的每一个任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代，其中(在杂芳基的情况下)可任选地存在至少一个羰基基团和/或其中可能的取代基在每种情况下为：氰基、羧基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三-(C₁-C₆) 烷基甲硅烷基、(C₃-C₈) 环烷基、(C₃-C₈) 环烷基-(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基-(C₃-C₈) 环烷基、卤代(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷基、(C₁-C₆) 氰基烷基、(C₁-C₆) 羟基烷基、羟基羰基-(C₁-C₆) -烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 卤代烯基、(C₂-C₆) 氰基烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₂-C₆) 卤代炔基、(C₂-C₆) 氰基炔基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 氰基烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 卤代烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 卤代烷硫基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷硫基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、二-(C₂-C₆) -烯基氨基羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆) 烷基氨基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰亚胺基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基、(C₁-C₆) 烷基羰基氨基，

R¹表示氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三-(C₁-C₆) 烷基甲硅烷基、(C₃-C₈) 环烷基、(C₃-C₈) 环烷基-(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基-(C₃-C₈) 环烷基、卤代(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷基、(C₁-C₆) 氰基烷基、(C₁-C₆) 羟基烷基、羟基羰基-(C₁-C₆) -烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 卤代烯基、(C₂-C₆) 氰基烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₂-C₆) 卤代炔基、(C₂-C₆) 氰基炔基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 氰基烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 卤代烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 卤代烷硫基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷硫基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基

硫代羰基、(C₁-C₆) 卤代烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 卤化烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、二-(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆) 烷基氨基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰亚胺基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基-氨基硫代羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基、NHC(=O)-(C₁-C₆) 烷基((C₁-C₆) 烷基羰基氨基)，

X表示部分饱和或饱和的杂环或杂芳族8元、9元、10元、11元或12元稠合的双环或三环体系，其中任选地可存在至少一个羰基基团和/或其中环体系任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代，且其中所述取代基可彼此独立地选自氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三(C₁-C₆) 烷基甲硅烷基、(C₃-C₈) 环烷基、(C₃-C₈) 环烷基-(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基-(C₃-C₈) 环烷基、卤代(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷基、(C₁-C₆) 氰基烷基、(C₁-C₆) 羟基烷基、羟基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 卤代烯基、(C₂-C₆) 氰基烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₂-C₆) 炔氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₆) 卤代炔基、(C₂-C₆) 氰基炔基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 卤代烯氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 氰基烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 卤代烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 卤代烷硫基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷硫基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基硫代羰基、(C₁-C₆) 卤代烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、二-(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆) 烷基氨基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰亚胺基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基、NHC(=O)-(C₁-C₆) 烷基((C₁-C₆) 烷基羰基氨基)，

或其中取代基可彼此独立地选自苯基或5元或6元杂芳族环，其中苯基或所述环可任选地被相同或不同的选自以下的取代基单取代或多取代：C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₂-C₆-卤代烯基、C₂-C₆-卤代炔基、C₃-C₆-卤代环烷基、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基，



R⁸表示氢或表示在每种情况下任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代的以下基

团:氨基、 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_3-C_{12} -环烷基、 C_3-C_{12} -环烷基- C_1-C_6 -烷基或 C_4-C_{12} -二环烷基,其中所述取代基可彼此独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰亚胺基、 C_1-C_4 -烷基磺酰亚胺基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基磺酰亚胺基- C_2-C_5 -烷基羰基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰亚胺基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰亚胺基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰亚胺基- C_2-C_5 -烷基羰基、 C_2-C_6 -烷氧基羰基、 C_2-C_6 -烷基羰基、 C_3-C_6 -三烷基甲硅烷基、氨基、 C_1-C_4 -烷基氨基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基、 C_3-C_6 -环烷基氨基、苯环或3元至6元芳族、部分饱和或饱和的杂环,其中苯环或杂环在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代,且其中所述取代基可彼此独立地选自: C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_2-C_6 -卤代烯基、 C_2-C_6 -卤代炔基、 C_3-C_6 -卤代环烷基、卤素、CN、 $(C=O)OH$ 、 $CONH_2$ 、 NO_2 、OH、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷硫基、 C_1-C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基、 C_1-C_4 -烷基氨基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基、 C_3-C_6 -环烷基氨基、 (C_1-C_6) -烷基羰基、 (C_1-C_6) -烷氧基羰基、 (C_1-C_6) -烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、三- (C_1-C_2) -烷基甲硅烷基、 (C_1-C_4) -烷基- (C_1-C_4) -烷氧基)亚氨基,或

R^8 表示苯环或3元至6元芳族、部分饱和或饱和的杂环,其中杂原子选自N、S、O,其中苯环或杂环在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代,且其中所述取代基可彼此独立地选自 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_2-C_6 -卤代烯基、 C_2-C_6 -卤代炔基、 C_3-C_6 -卤代环烷基、卤素、CN、 $(C=O)OH$ 、 $CONH_2$ 、 NO_2 、OH、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷硫基、 C_1-C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基、 C_1-C_4 -烷基氨基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基、 C_3-C_6 -环烷基氨基、 (C_1-C_6) -烷基羰基、 (C_1-C_6) -烷氧基羰基、 (C_1-C_6) -烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、三- (C_1-C_2) -烷基甲硅烷基、 (C_1-C_4) -烷基- (C_1-C_4) -烷氧基)亚氨基,

R_{13} 、 R_{14} 、 R_{15} 彼此独立的表示在每种情况下任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代的以下基团: C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_{12} -烷氧基、 C_3-C_{12} -环烷基- C_1-C_6 -烷基或 C_4-C_{12} -二环烷基,其中所述取代基可彼此独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰亚胺基、 C_1-C_4 -烷基磺酰亚胺基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基磺酰亚胺基- C_2-C_5 -烷基羰基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰亚胺基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰亚胺基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰亚胺基- C_2-C_5 -烷基羰基、 C_2-C_6 -烷氧基羰基、 C_2-C_6 -烷基羰基、 C_3-C_6 -三烷基甲硅烷基、氨基、 C_1-C_4 -烷基氨基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基、 C_3-C_6 -环烷基氨基、苯环或3元或6元芳族、部分饱和或饱和的杂环,其中苯环或杂环在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代,且其中所述取代基可彼此独立地选自 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_2-C_6 -卤代烯基、 C_2-C_6 -卤代炔基、 C_3-C_6 -卤代环烷基、卤素、氰基、 $(C=O)OH$ 、 $CONH_2$ 、 NO_2 、OH、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷硫基、 C_1-C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基、 C_1-C_4 -烷基氨基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基、 C_3-C_6 -环烷基氨基、 (C_1-C_6) -烷基羰基、 (C_1-C_6) -烷氧基羰基、 (C_1-C_6) -烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) -烷基氨基羰基、

三- (C₁-C₂) 烷基甲硅烷基、(C₁-C₄-烷基) (C₁-C₄-烷氧基) 亚氨基,

R¹³、R¹⁴、R¹⁵彼此独立地表示苯环或3元至6元芳族、部分饱和或饱和的杂环,其中杂原子选自N、S、O,其中苯环或杂环在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代,且其中所述取代基可彼此独立地选自C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₂-C₆-卤代烯基、C₂-C₆-卤代炔基、C₃-C₆-卤代环烷基、卤素、氰基、(C=O)OH、CONH₂、NO₂、OH、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、C₁-C₄-烷基氨基、二-(C₁-C₄-烷基)氨基、C₃-C₆-环烷基氨基、(C₁-C₆-烷基)羰基、(C₁-C₆-烷氧基)羰基、(C₁-C₆-烷基)氨基羰基、二-(C₁-C₄-烷基)氨基羰基、三-(C₁-C₂) 烷基甲硅烷基、(C₁-C₄-烷基) (C₁-C₄-烷氧基) 亚氨基,

R¹¹、R¹²彼此独立地表示氢或表示R¹³,

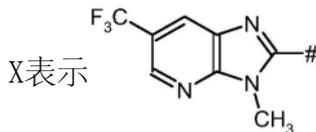
m表示0、1或2,

n表示0、1或2,

p表示0或1,

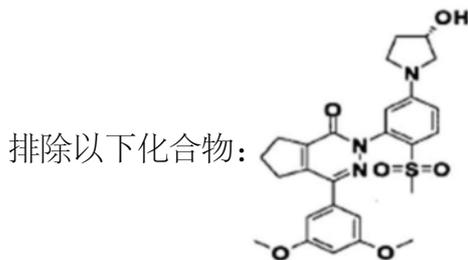
其中如果R²表示任选取代的Q45,则X不表示H1、H2或H4,如果R²表示G10、G11、G12、G13、G14、G15或G16且A¹表示N,则X不表示H1、H2、H4、H5、H7、H8或H14,

排除式(I)的化合物,其中



且A¹表示N或CH, R¹表示乙基, R²表示S-甲基, R³表示氢且n表示0

或A¹表示N或CH, R¹表示乙基, R²表示O-甲基, R³表示氢且n表示0、1或2,



2. 根据权利要求1的式(I)的化合物,其中

A¹表示氮、=N⁺-O⁻或=C-R⁴,

R¹表示(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 羟基烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 氰基烷基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 烯基、(C₂-C₄) 烯氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 卤代烯氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 卤代烯基、(C₂-C₄) 氰基烯基、(C₂-C₄) 炔基、(C₂-C₄) 炔氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 卤代炔氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 卤代炔基、(C₂-C₄) 氰基炔基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₃-C₆) 环烷基(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷基-(C₃-C₆) 环烷基、卤代(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷基氨基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基、(C₃-C₆) 环烷基氨基、(C₁-C₄) 烷基羰基氨基、(C₁-C₄) 烷基磺基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基磺基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基亚磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基羰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基羰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氨基,

或表示(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基,这些基团中的每一个任选地被选自以下的相同或不同的取代基单取代或双取代:芳基、杂芳基和杂环基,其中芳基、杂芳基和杂环基在每种情况下可任选地被相同或不同的选自以下的取代基单取代或双取代:卤素、氰基、氨基甲酰基、氨基磺酰基、(C₁-C₄)-烷基、(C₃-C₄)-环烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基、(C₁-C₄)-烷硫基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰亚胺基,或

R¹表示芳基、杂芳基或杂环基,这些基团中的每一个任选地被选自以下的相同或不同的取代基单取代或双取代:卤素、氰基、氨基甲酰基、(C₁-C₄)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基、(C₁-C₄)-烷硫基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰亚胺基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰亚胺基、(C₁-C₄)-烷基羰基、(C₃-C₄)-三烷基甲硅烷基、(=O) (仅在杂环基的情况下)和(=O)₂ (仅在杂环基的情况下),

R²表示饱和杂环、部分饱和杂环或杂芳族环,其任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代,其中至少一个碳原子被选自N、O和S的杂原子替代,其中在每种情况下任选地可存在至少一个羰基基团和/或其中可能的取代基在每种情况下为:氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、氨基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-氰基烷基、(C₁-C₄)-羟基烷基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-卤代烯基、(C₂-C₄)-氰基烯基、(C₂-C₄)-炔基、(C₂-C₄)-卤代炔基、(C₂-C₄)-氰基炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基、(C₁-C₄)-氰基烷氧基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-烷氧基亚氨基、-N=C(H)-O(C₁-C₄)-烷基、-C(H)=N-O(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基-(C₁-C₄)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₄)-烷硫基、(C₁-C₄)-卤代烷硫基、(C₁-C₄)-烷硫基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基氧基、(C₁-C₄)-烷基羰基、(C₁-C₄)-卤代烷基羰基、氨基羰基、(C₁-C₄)-烷基氨基羰基、二-(C₁-C₄)-烷基氨基羰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基氨基、(C₁-C₄)-烷基氨基、二-(C₁-C₄)-烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₄)-烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₄)-烷基氨基磺酰基、(C₁-C₄)-烷基羰基氨基,

R²还表示选自以下的基团-C(=O)-R⁸(G1)、-C(=S)-R⁸(G2)、-C(=O)-NR¹¹R¹²(G3)、-C(=S)-NR¹¹R¹²(G4)、-S=O(=NH)-R¹³(G6)、-S=O(=N-CN)-R¹³(G7)、-S(=N-CN)-R¹³(G8)、-S(O)₂-NR¹¹R¹²(G9)、-NR¹¹R¹²(G10)、-NR¹¹-NR¹¹R¹²(G11)、-NR¹¹-C(=O)-R⁸(G12)、-NR¹¹-C(=S)-R⁸(G13)、-NR¹¹-S(O)₂-R¹³(G14)、-N(R¹¹)-O-R¹³(G15)、-N=S(=O)_p-R¹⁴R¹⁵(G16)、-CR¹¹=N-OR¹³(G18)或-CR¹¹=CR⁸R¹²G(19),其中如果R²表示G6、G7、G8、G9,则n表示2,

R³表示氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三(C₁-C₄)-烷基甲硅烷基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基-(C₃-C₆)-环烷基、卤代(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-氰基烷基、(C₁-C₄)-羟基烷基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-卤代烯基、(C₂-C₄)-氰基烯基、(C₂-C₄)-炔基、(C₂-C₄)-卤代炔基、(C₂-C₄)-氰基炔基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基、(C₁-C₄)-氰基烷氧基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-烷基羟基亚氨基、(C₁-C₄)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₄)-烷基-(C₁-C₄)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₄)-卤代烷基-(C₁-C₄)-烷氧基亚氨基、(C₁-C₄)-烷硫基、(C₁-C₄)-卤代烷硫基、(C₁-C₄)-

烷硫基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氧基、 (C_1-C_4) 烷基羰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基羰基、氨基羰基、氨基硫代羰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氨基、 (C_1-C_4) 烷基氨基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基、氨基硫代羰基、 $NHCO-(C_1-C_4)$ 烷基((C_1-C_4) 烷基羰基氨基)，

还表示苯基或杂芳基，这些基团中的每一个任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代，其中(在杂芳基的情况下)可任选地存在至少一个羰基基团和/或其中可能的取代基在每种情况下为：氰基、卤素、硝基、乙酰基、氨基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基- (C_3-C_6) 环烷基、卤代 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 氰基烷基、 (C_1-C_4) 羟基烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 卤代烯基、 (C_2-C_4) 氰基烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_2-C_4) 卤代炔基、 (C_2-C_4) 氰基炔基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) 氰基烷氧基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷基羟基亚氨基、 (C_1-C_4) 烷氧基亚氨基、 (C_1-C_4) 烷基- (C_1-C_4) 烷氧基亚氨基、 (C_1-C_4) 卤代烷基- (C_1-C_4) 烷氧基亚氨基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 卤代烷硫基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氧基、 (C_1-C_4) 烷基羰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基羰基、氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氨基、 (C_1-C_4) 烷基氨基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基、 $NHCO-(C_1-C_4)$ 烷基((C_1-C_4) 烷基羰基氨基)，

R^4 表示氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、 SCN 、三- (C_1-C_4) 烷基甲硅烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基- (C_3-C_6) 环烷基、卤代 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 氰基烷基、 (C_1-C_4) 羟基烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 卤代烯基、 (C_2-C_4) 氰基烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_2-C_4) 卤代炔基、 (C_2-C_4) 氰基炔基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) 氰基烷氧基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷基羟基亚氨基、 (C_1-C_4) 烷氧基亚氨基、 (C_1-C_4) 烷基- (C_1-C_4) 烷氧基亚氨基、 (C_1-C_4) 卤代烷基- (C_1-C_4) 烷氧基亚氨基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 卤代烷硫基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氧基、 (C_1-C_4) 烷基羰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基羰基、氨基羰基、氨基硫代羰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氨基、 (C_1-C_4) 烷基氨基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基、氨基硫代羰基、 $NHCO-(C_1-C_4)$ 烷基((C_1-C_4) 烷基羰基氨基)，

X 表示杂芳族8元、9元、10元、11元或12元稠合的双环或三环环体系，其中所述环体系任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代，且其中所述取代基可彼此独立地选自氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、 SCN 、三- (C_1-C_6) 烷基甲硅烷基、 (C_3-C_8) 环烷基、 (C_3-C_8) 环烷基- (C_3-C_8) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷基- (C_3-C_8) 环烷基、卤代 (C_3-C_8) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 卤代烷基、 (C_1-C_6) 氰基烷基、 (C_1-C_6) 羟基烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯

基、(C₂-C₆) 卤代烯基、(C₂-C₆) 氰基烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₂-C₆) 炔氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₆) 卤代炔基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 卤代烯氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 氰基烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 卤代烷硫基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷硫基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基硫代羰基、(C₁-C₆) 卤代烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆) 烷基氨基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰亚胺基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基、NHC(O)-(C₁-C₆) 烷基((C₁-C₆) 烷基羰基氨基)，

或其中取代基可彼此独立地选自苯基或5元或6元杂芳族环，其中苯基或所述环可任选地被相同或不同的选自以下的取代基单取代或多取代：C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₂-C₆-卤代烯基、C₂-C₆-卤代炔基、C₃-C₆-卤代环烷基、卤素、CN、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基，



R⁸表示氢、氨基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷硫基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基氨基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基或C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基，这些基团中的每一个任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代，其中所述取代基可彼此独立地选自卤素、氰基、苯环或3元至6元芳族、部分饱和或饱和的杂环，其中苯环或杂环在每种情况下可被相同或不同的取代基单取代或多取代，且其中所述取代基可彼此独立地选自C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、卤素、氰基、NO₂、C₁-C₄-烷氧基或C₁-C₄-卤代烷氧基，或

R⁸表示苯环或3元至6元芳族、部分饱和或饱和的杂环，其中杂原子选自N、S和O，其中苯环或杂环在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代，且其中取代基可彼此独立地选自C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、卤素或氰基，

R¹³、R¹⁴、R¹⁵彼此独立地表示C₁-C₄-烷基或C₃-C₆-环烷基，这些基团中的每一个任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代，其中所述取代基可彼此独立地选自卤素、氰基、苯环或3元至6元芳族、部分饱和或饱和的杂环，其中苯环或杂环在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代，且其中所述取代基可彼此独立地选自C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、卤素、氰基、NO₂、C₁-C₄-烷氧基和C₁-C₄-卤代烷氧基，或

R¹³、R¹⁴、R¹⁵彼此独立地表示苯环或3元至6元芳族、部分饱和或饱和的杂环，其中杂原子

选自N、S和O,其中苯环或杂环在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代,且其中所述取代基可彼此独立地选自C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、卤素或氰基,

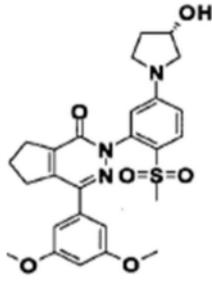
R¹¹、R¹²彼此独立地表示氢或表示R¹³,

n表示0、1或2,

p表示0或1,

其中如果R²表示任选取代的Q45,则X不为H1、H2或H4,如果R²表示G10、G11、G12、G13、G14、G15或G16且A¹表示N,则X不表示H1、H2、H4、H5、H7、H8或H14,

排除以下化合物:

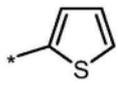


3. 根据权利要求1的式(I)的化合物,其中

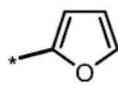
A¹表示氮或=C-R⁴,

R¹表示(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-羟基烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-卤代烯基、(C₂-C₄)-炔基、(C₂-C₄)-卤代炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷硫基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基-(C₁-C₄)-烷基或(C₁-C₄)-烷基磺酰基-(C₁-C₄)-烷基,

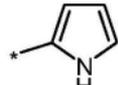
R²表示选自任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代Q1至Q101的5元或6元饱和的环、部分饱和的环或杂芳环,其在每种情况下可含有至少一个羰基基团和/或其中可能的取代基在每种情况下为:氢、氰基、(C₁-C₄)氰基烷基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₄)烷基、卤素、氨基、(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)卤代烷基、(C₂-C₄)烯基、(C₂-C₄)卤代烯基、(C₂-C₄)炔基、(C₂-C₄)卤代炔基、(C₃-C₆)环烷基、(C₃-C₆)环烷基-(C₃-C₆)环烷基、(C₁-C₄)烷基-(C₃-C₆)环烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)卤代烷氧基、(C₁-C₄)烷氧基亚氨基、-C(H)=N-O(C₁-C₄)烷基、(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)烷基磺酰基-(C₁-C₄)烷基、(C₁-C₄)卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄)烷基磺酰基氧基、(C₁-C₄)烷基羰基、(C₁-C₄)卤代烷基羰基、氨基羰基、(C₁-C₄)烷基氨基羰基、二-(C₁-C₄)烷基氨基羰基、(C₁-C₄)烷基磺酰基氨基、(C₁-C₄)烷基氨基、二-(C₁-C₄)烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₄)烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₄)烷基氨基磺酰基、(C₁-C₄)烷基羰基氨基,



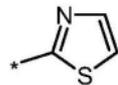
Q-1



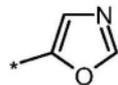
Q-2



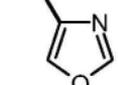
Q-3



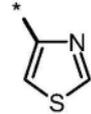
Q-4



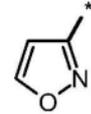
Q-5



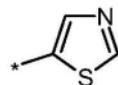
Q-6



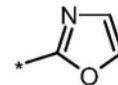
Q-7



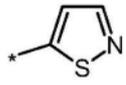
Q-8



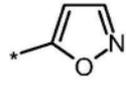
Q-9



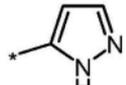
Q-10



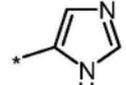
Q-11



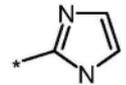
Q-12



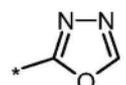
Q-13



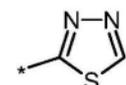
Q-14



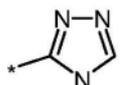
Q-15



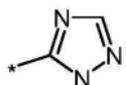
Q-16



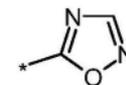
Q-17



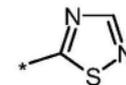
Q-18



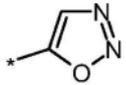
Q-19



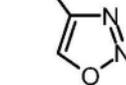
Q-20



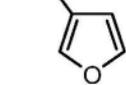
Q-21



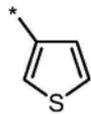
Q-22



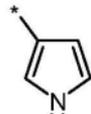
Q-23



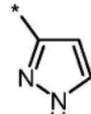
Q-24



Q-25



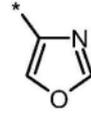
Q-26



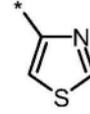
Q-27



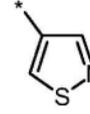
Q-28



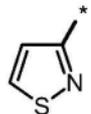
Q-29



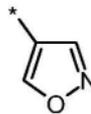
Q-30



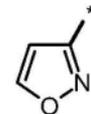
Q-31



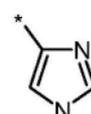
Q-32



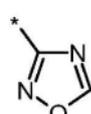
Q-33



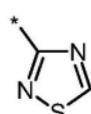
Q-34



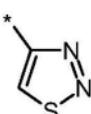
Q-35



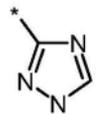
Q-36



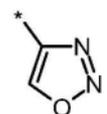
Q-37



Q-38



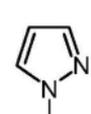
Q-39



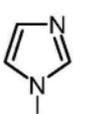
Q-40



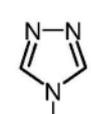
Q-41



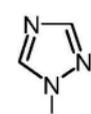
Q-42



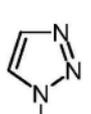
Q-43



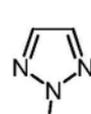
Q-44



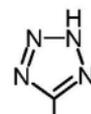
Q-45



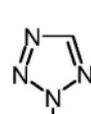
Q-46



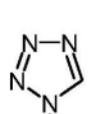
Q-47



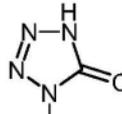
Q-48



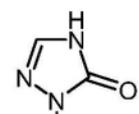
Q-49



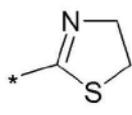
Q-50



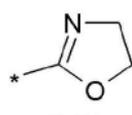
Q-51



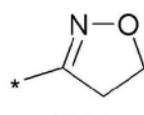
Q-52



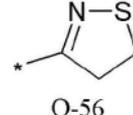
Q-53



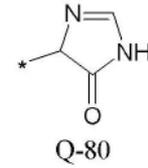
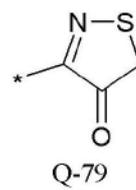
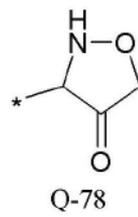
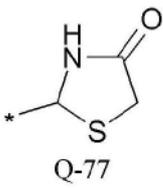
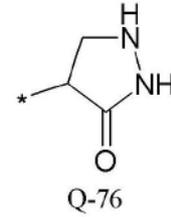
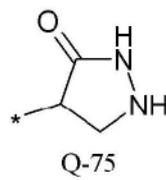
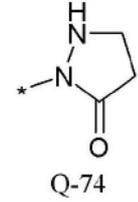
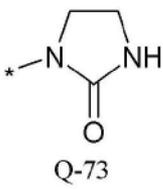
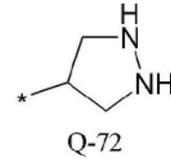
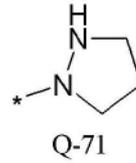
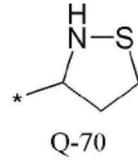
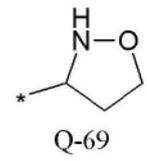
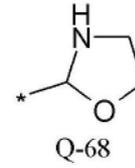
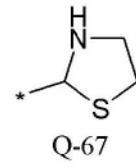
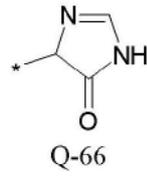
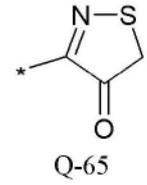
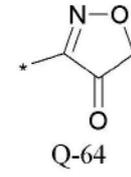
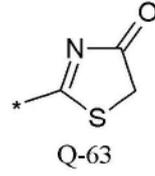
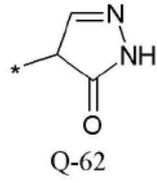
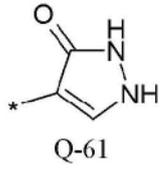
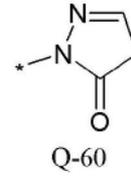
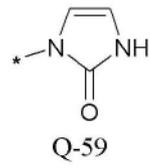
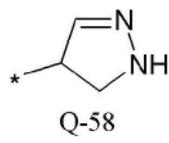
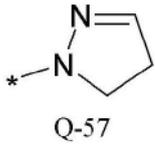
Q-54

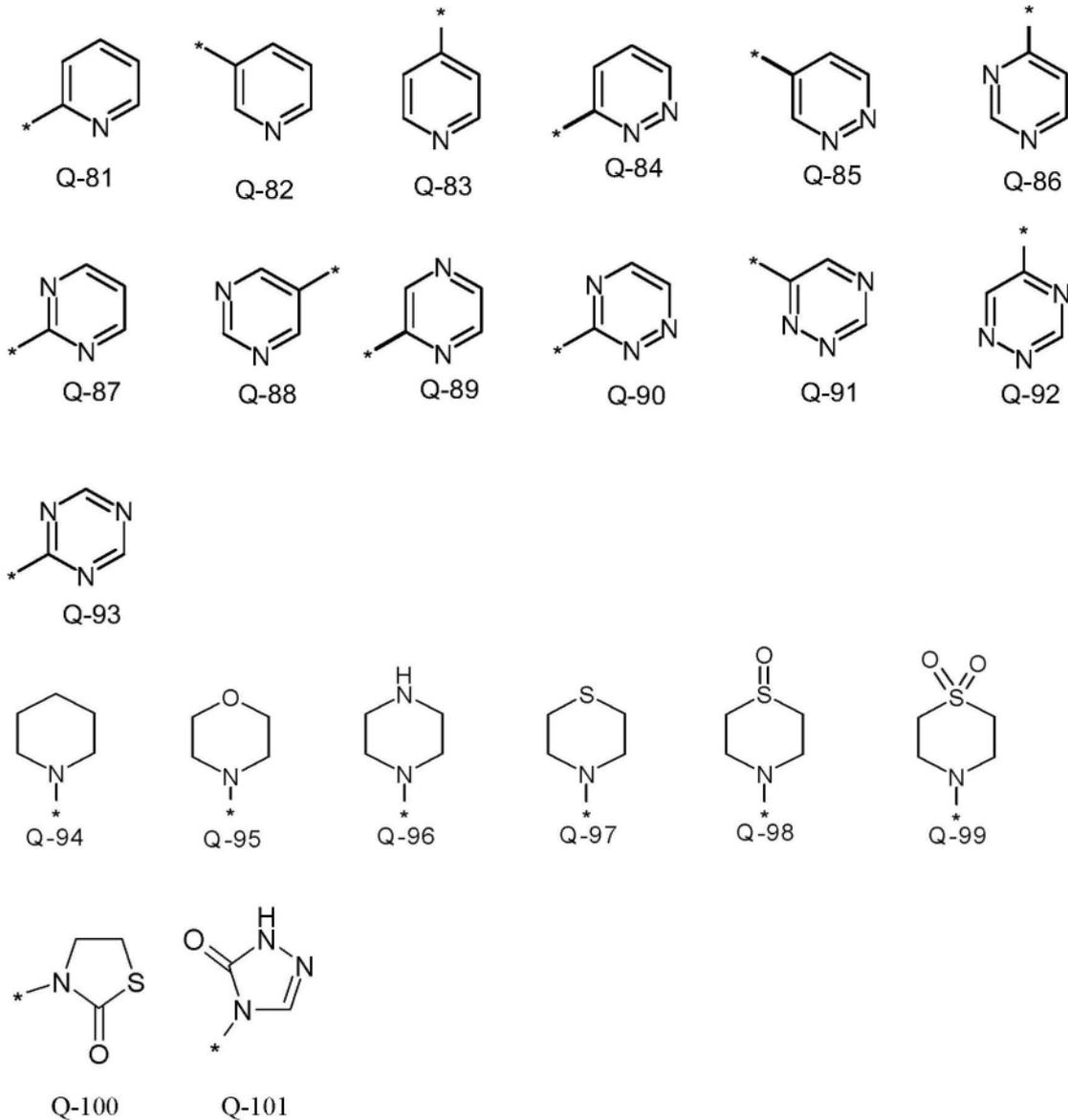


Q-55



Q-56





其中连接至分子剩余部分的键由星号*表示，

R^2 还表示选自以下的基团：G1、G2、G3、G4、G6、G7、G8、G9、G10、G11、G12、G13、G14、G15、G16、G18或G19，

其中如果 R^2 表示G6、G7、G8、G9，则n表示2，

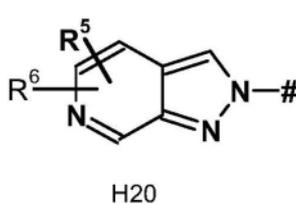
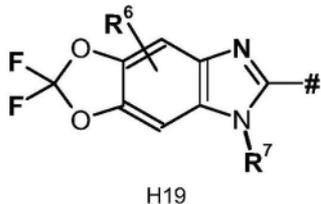
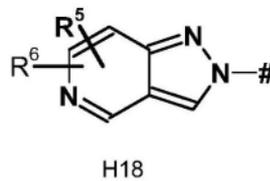
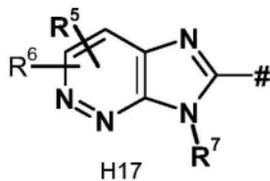
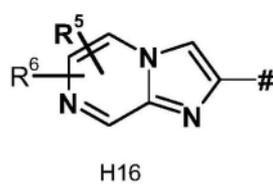
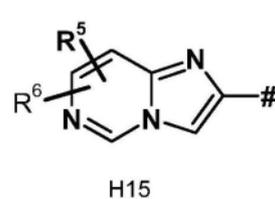
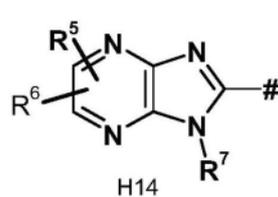
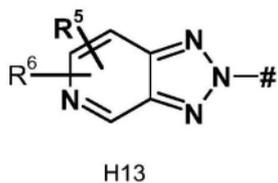
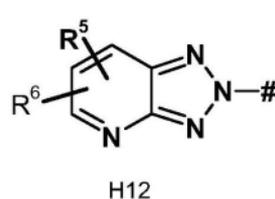
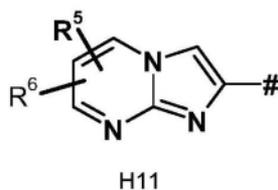
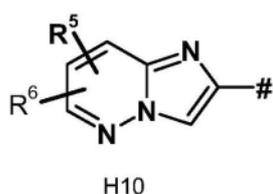
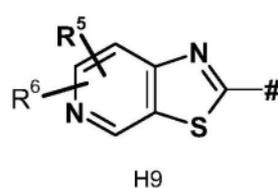
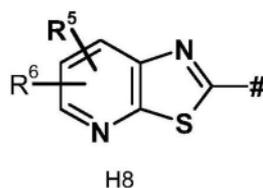
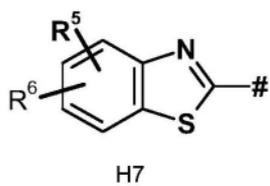
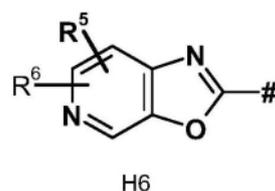
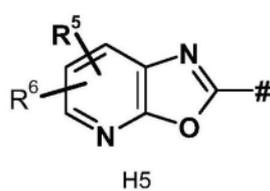
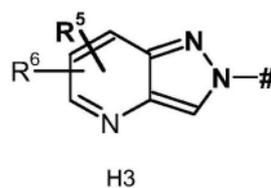
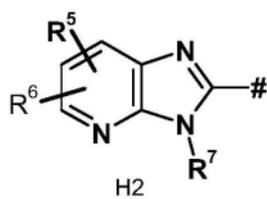
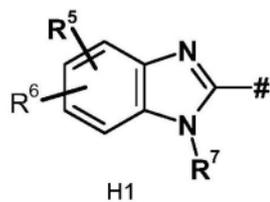
R^3 表示氢、氰基、卤素、硝基、羟基、氨基、SCN、三- (C_1-C_4) 烷基甲硅烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基- (C_3-C_6) 环烷基、卤代 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 氰基烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 卤代烯基、 (C_2-C_4) 氰基烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_2-C_4) 卤代炔基、 (C_2-C_4) 氰基炔基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) 氰基烷氧基、 (C_1-C_4) 烷基羟基亚氨基、 (C_1-C_4) 烷氧基亚氨基、 (C_1-C_4) 烷基- (C_1-C_4) 烷氧基亚氨基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 卤代烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氧基、 (C_1-C_4) 烷基羰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基羰基、氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氨基、 (C_1-C_4) 烷基氨基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基、NHC(=O)- (C_1-C_4) 烷基($(C_1-$

C₄) 烷基羰基氨基),

还表示苯基或杂芳基,这些基团中的每一个任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代,其中(在杂芳基的情况下)可任选地存在至少一个羰基基团和/或其中可能的取代基在每种情况下为:氰基、卤素、(C₃-C₆) 环烷基、(C₃-C₆) 环烷基-(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷基-(C₃-C₆) 环烷基、卤素 (C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 氰基烷基、(C₂-C₄) 烯基、(C₂-C₄) 卤代烯基、(C₂-C₄) 氰基烯基、(C₂-C₄) 炔基、(C₂-C₄) 卤代炔基、(C₂-C₄) 氰基炔基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 卤代烷氧基、(C₁-C₄) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷基-(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(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-C₄) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₄) 烷基羰基、(C₁-C₄) 卤代烷基羰基、氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₄) 烷基氨基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、NHC(=O)-(C₁-C₄) 烷基((C₁-C₄) 烷基羰基氨基),

R⁴表示氢、卤素、氰基或(C₁-C₄)-烷基,

X表示来自系列H1至H20的杂芳族9元或12元稠合的双环或三环环体系,



其中连接至分子剩余部分的键由井号#标识，

R^5 、 R^6 彼此独立地表示氢、氰基、卤素、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 $(C_2-$

C_4 卤代烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_2-C_4) 卤代炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) 烷基氨基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氧基、 (C_1-C_4) 烷基羰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基羰基、氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氨基、 (C_1-C_4) 烷基氨基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基或二- (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基，

R^7 表示 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 氰基烷基、 (C_1-C_4) 羟基烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 烯氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 卤代烯氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 卤代烯基、 (C_2-C_4) 氰基烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_2-C_4) 炔氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 卤代炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基- (C_3-C_6) 环烷基、卤代 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基- (C_1-C_4) 烷基或 (C_1-C_4) 烷基羰基- (C_1-C_4) 烷基，

R^8 表示氢、氨基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基氨基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_3-C_6) 环烷基或 (C_3-C_6) 环烷基- (C_1-C_4) 烷基，表示在每种情况下任选地被卤素、氰基、苯基或吡啶基单取代的 (C_1-C_4) 烷基或 (C_1-C_4) 烷氧基，其中苯基或吡啶基在每种情况下可任选地被选自三氟甲基、氰基、氟、氯、溴或三氟甲氧基的相同或不同的取代基单取代或双取代，或

R^8 表示苯基、噁唑基、吡唑基、吡啶基或包含选自N、S和O的1-2个杂原子的3元至6元饱和杂环，其中苯基、吡啶基和杂环各自可任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代，且其中取代基可彼此独立地选自 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、卤素或氰基，

R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 彼此独立地表示 (C_1-C_4) 烷基或 (C_3-C_6) 环烷基，任选地被卤素、氰基、苯基或吡啶基单取代，其中苯基或吡啶基在每种情况下可任选地被选自三氟甲基、氰基、氟、氯或三氟甲氧基的相同或不同的取代基单取代或双取代，或

R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 彼此独立地表示苯基、吡啶基或包含选自N、S和O的1-2个杂原子的3元至6元饱和杂环，其中苯基、吡啶基和杂环各自可被相同或不同的取代基单取代或双取代，且其中取代基可彼此独立地选自 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、卤素和氰基，

R^{11} 、 R^{12} 彼此独立地表示氢或表示 R^{13} ，

n表示0、1或2，

p表示0或1，

其中如果 R^2 表示任选取代的Q45，则X不为H1、H2或H4，如果 R^2 表示G10、G11、G12、G13、G14、G15或G16且 A^1 表示N，则X不表示H1、H2、H4、H5、H7、H8或H14。

4. 根据权利要求1的式(I)的化合物，其中

A^1 表示氮或 $=C-R^4$ ，

R^1 表示甲基、乙基、正丙基、异丙基、环丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、环丁基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟乙基、二氟乙基、三氟乙基、四氟乙基或五氟乙基，

R^2 表示任选地被氰基、 (C_1-C_4) 氰基烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、卤素、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 卤代烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷基羰基氨基单取代的环，所述环选自Q-25、Q-41、Q-42、

Q-43、Q-44、Q-45、Q-46、Q-47、Q-52或Q-95,

R^2 还表示选自G1、G2、G3、G4、G10、G11、G12、G13、G14、G15、G18或G19的基团,

R^3 表示氢、氰基、卤素、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷硫基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基磺酰基或NHC(O)- (C_1-C_4) 烷基((C_1-C_4) 烷基羰基氨基),

R^4 表示氢、氟、氯、溴或氰基,

X表示选自系列H1、H2、H3、H4、H5、H7、H8、H10、H11、H12、H13、H15、H16、H17、H18、H19或H20的杂芳族9元或12元稠合的双环或三环体系,

R^5 表示氢、氰基、卤素、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 卤代烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_2-C_4) 卤代炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) 烷氧基亚氨基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 卤代烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基羰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基羰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氨基、 (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基或二- (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基,

R^6 表示氢,

R^7 表示 (C_1-C_4) 烷基或 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) -烷基,

R^8 表示氢、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基- (C_1-C_4) 烷基或 (C_1-C_4) 烷氧基,或

R^8 表示苯基或吡啶基,其中苯基或吡啶基在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代,且其中取代基可彼此独立地选自 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、卤素和氰基,

R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 彼此独立地表示 (C_1-C_4) 烷基或 (C_3-C_6) 环烷基或

R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 彼此独立地表示苯基或吡啶基,其中苯基或吡啶基在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代,且其中所述取代基可彼此独立地选自 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、卤素和氰基,或表示氧杂环丁烷基,

R^{11} 、 R^{12} 彼此独立地表示氢或表示 R^{13} ,

n表示0、1或2,

p表示0或1,

其中如果 R^2 表示任选取代的Q45,则X不为H1、H2或H4,如果 R^2 表示G10、G11、G12、G13、G14或G15且 A^1 表示N,则X不表示H1、H2、H4、H5、H7或H8。

5. 根据权利要求1的式(I)的化合物,其中

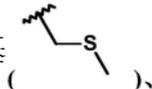
A^1 表示氮,

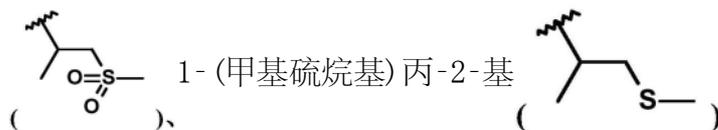
R^1 表示甲基、乙基、正丙基、异丙基或环丙基,

R^2 表示选自系列Q-42、Q-43、Q-45或Q-47的任选地被氟、氯、溴、碘、三氟甲基、二氟甲基或五氟乙基单取代的环,

R^2 还表示选自G10的基团,其中 R^{11} 为氢且 R^{12} 为氢或氧杂环丁烷基

或G12,其中 R^{11} 表示氢且 R^8 表示氢、甲基、乙基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、二氟甲基、四

氟乙基、五氟乙基、环丙基、环丙基甲基、甲基硫烷基甲基 , 甲基磺酰基丙-2-基



或G3,其中R¹¹表示氢且R¹²表示甲基、乙基、异丙基、环丙基或叔丁基,
R³表示氢,

X表示选自系列H1、H2、H5、H15、H16、H17或H19的杂芳族9元或12元稠合的双环或三环环体系,

R⁵表示氟、氯、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟乙基、二氟乙基、三氟乙基、四氟乙基、五氟乙基、三氟甲氧基、二氟氯甲氧基、二氯氟甲氧基、三氟甲硫基、三氟甲基磺酰基或三氟甲基亚磺酰基,

R⁶表示氢,

R⁷表示甲基、乙基、异丙基、甲氧基甲基或甲氧基乙基,

n表示0、1或2,

其中如果R²表示任选取代的Q45,则X不为H1或H2,如果R²表示G10或G12,则X不表示H1、H2或H5。

6. 根据权利要求1的式(I)的化合物,其中

A¹表示氮,

R¹表示乙基,

R²表示选自系列Q-42、Q-43、Q-45或Q-47的任选地被氟、氯或三氟甲基单取代的环,

R²还表示选自G10的基团,其中R¹¹表示氢且R¹²表示氢或  或G12,其中R¹¹表示氢且R⁸

表示甲基、三氟甲基、环丙基、-CH₂SCH₃、-CH(CH₃)CH₂SCH₃或-CH(CH₃)CH₂SO₂CH₃

或G3,其中R¹¹表示氢且R¹²表示甲基,

R³表示氢,

X表示选自系列H1、H2、H5、H15、H16、H17或H19的杂芳族9元或12元稠合的双环或三环环体系,

R⁵表示三氟甲基

R⁶表示氢,

R⁷表示甲基,

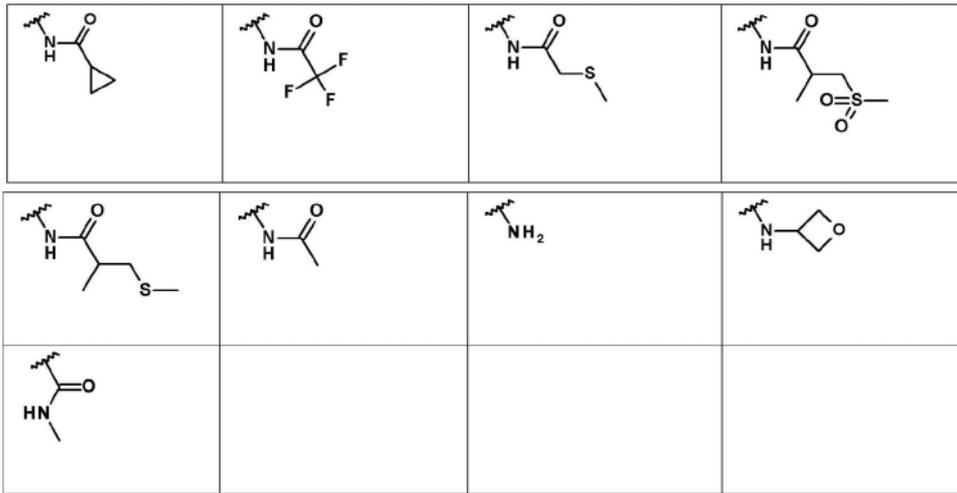
n表示0、1或2,

其中如果R²表示任选取代的Q45,则X不为H1或H2,如果R²表示G10或G12,则X不表示H1、H2或H5。

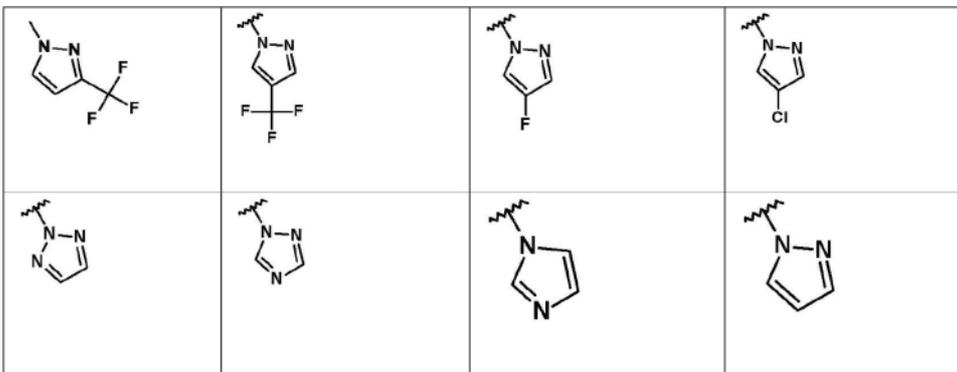
7. 根据权利要求1的式(I)的化合物,其中

A¹、R¹、R³、R⁵、R⁶、R⁷、X和n具有上文所给出的含义且

R²表示选自如下系列的基团:

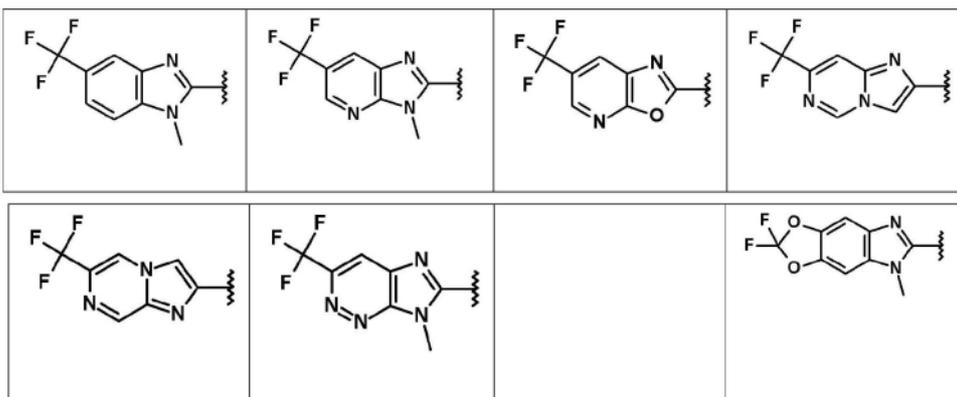


R²还表示选自如下系列的基团：



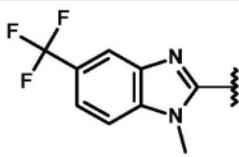
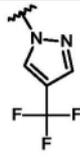
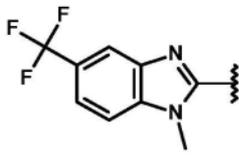
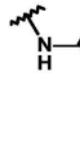
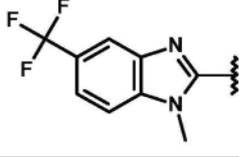
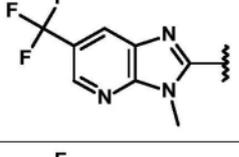
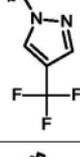
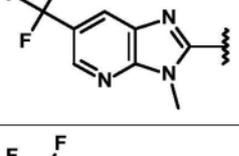
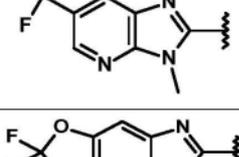
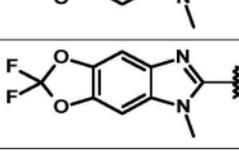
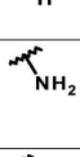
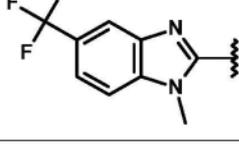
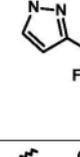
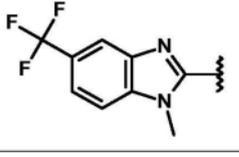
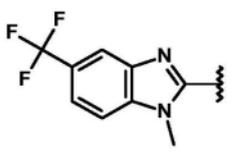
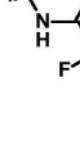
其中如果R²表示任选取代的Q45,则X不为H1或H2,如果R²表示G10或G12,则X不表示H1、H2或H5。

8. 根据权利要求1的式(I)的化合物,其中
A¹、R¹、R²、R³、R⁵、R⁶、R⁷和n具有上文所给出的含义且
X表示选自如下系列的基团：

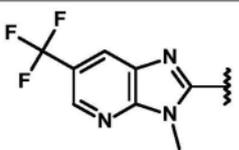
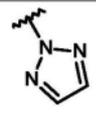
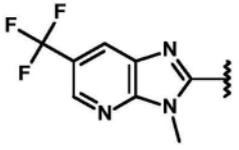
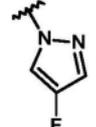
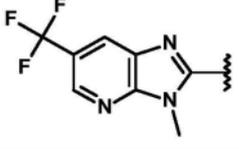
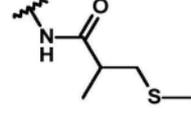
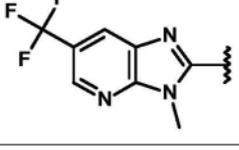
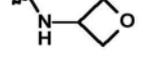
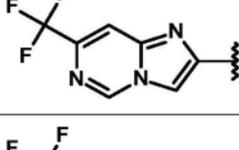
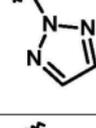
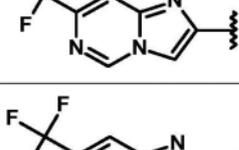
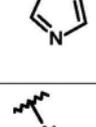
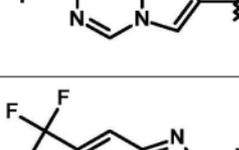
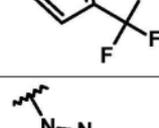
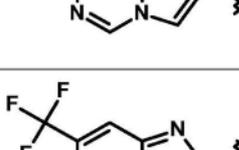
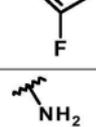
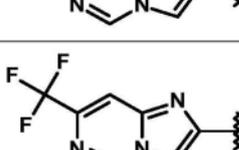
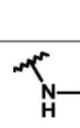


其中如果R²表示任选取代的Q45,则X不为H1或H2,如果R²表示G10或G12,则X不表示H1、H2或H5。

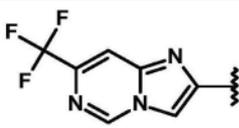
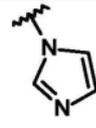
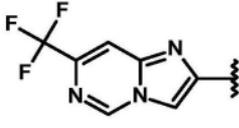
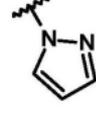
9. 根据权利要求1的式(I)的化合物,其中取代基R¹、R²、R³、A¹、X和n具有下表中给出的含义且其中X和R²连接至分子剩余部分的键由波浪线表示：

实施例	R ¹	n	A ¹	R ³	X	R ²
实施例 I-1	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-2	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-3	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-4	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-5	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-6	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-7	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-8	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-9	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-10	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-11	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

实施例 I-12	-CH ₂ CH ₃	1	N	H		
实施例 I-13	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-14	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-15	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-16	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-17	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-18	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-19	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-20	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-21	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

实施例 I-23	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-24	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-25	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-26	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-27	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-28	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-29	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-30	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-31	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-32	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

实施例 I-33	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
Bsp- I-34	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-35	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-38	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-39	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-40	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-41	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-42	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-43	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-44	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

实施例 I-45	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-46	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

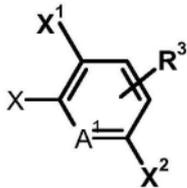
10. 农用化学品制剂,其包含权利要求1的式(I)的化合物以及填充剂和/或表面活性剂。

11. 根据权利要求10的农用化学品制剂,其还包含另外的农业化学活性化合物。

12. 防治动物害虫的方法,其特征在于,使权利要求1的式(I)的化合物或权利要求10或11的农用化学品制剂作用于动物害虫和/或其生境。

13. 权利要求1的式(I)的化合物或权利要求10或11的农用化学品制剂用于防治动物害虫的用途。

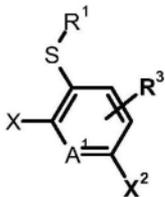
14. 式(IX)的化合物



其中

X、A¹和R³具有上述含义,X¹表示卤素且X²表示卤素。

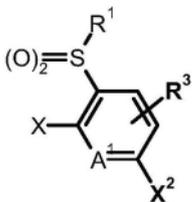
15. 式(XI)的化合物



其中

X、A¹、R¹和R³具有上述含义且X²表示卤素。

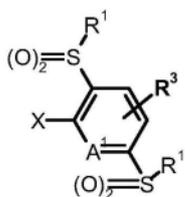
16. 式(XIII)的化合物



其中

X、A¹、R¹和R³具有上述含义,X²表示卤素。

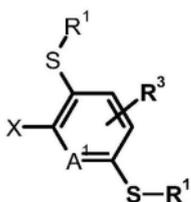
17. 式(LXXIII)的化合物



其中

X、A¹、R¹和R³具有上述含义。

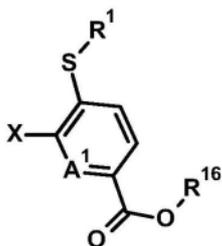
18. 式 (LXXI) 的化合物



其中

X、A¹、R¹和R³具有上述含义。

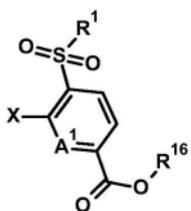
19. 式 (LXXIX) 的化合物



其中

X、A¹和R¹具有上述含义且R¹⁶表示甲基、乙基或丙基。

20. 式 (LXXX) 的化合物



其中

X、A¹和R¹具有上述含义且R¹⁶表示甲基、乙基或丙基。

作为农药的2-(杂)芳基取代的稠合杂环衍生物

[0001] 本申请是2016年8月4日提交的名称为“作为农药的2-(杂)芳基取代的稠合杂环衍生物”的申请号为201680058165.1的发明专利申请的分案申请。

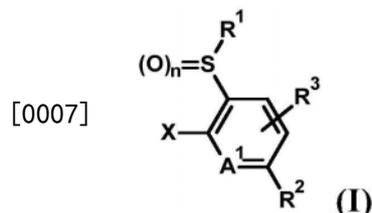
[0002] 本发明涉及新的式(I)的2-(杂)芳基取代的稠合杂环衍生物;其作为杀螨剂和/或杀虫剂用于防治动物害虫,特别是节肢动物且尤其是昆虫和蛛纲动物的用途;以及其制备方法和用于制备其的中间体。

[0003] 具有杀虫特性的稠合杂环衍生物已记载于例如以下文献中:WO 2010/125985、WO 2012/074135、WO 2012/086848、WO 2013/018928、WO 2013/191113、WO 2014/142292、WO 2014/148451、WO 2015/000715、EP 15153943.4、EP 15153948.3、WO 2015/121136、WO 2015/133603、WO 2015/198859、WO 2015/002211、WO 2015/071180、WO 2015/091945、WO 2016/005263、WO 2015/198817、WO 2016/041819、WO 2016/039441、WO 2016/026848、WO 2016/023954、WO 2016/020286、WO 2016/046071。

[0004] 然而,根据上述文献已知的活性化合物在施用时具有一些缺点,不是因为它们仅表现出窄的施用范围就是因为它们不具有令人满意的杀虫活性或杀螨活性。

[0005] 现已发现新的2-(杂)芳基取代的稠合杂环衍生物,并且它们具有优于已知化合物的优点,优点的实例为更好的生物学特性或环境特性、更多的施用方法、更好的杀虫活性或杀螨活性以及与作物植物良好的相容性。2-(杂)芳基取代的稠合杂环衍生物可以与其他用于改善功效的试剂结合使用,特别是对抗难以防治的昆虫。

[0006] 因此,本发明提供了新的式(I)的化合物



[0008] 其中(构型1-1)

[0009] A^1 表示氮、 $=N^+-O^-$ 或 $=C-R^4$,

[0010] R^1 表示 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_1-C_6) -氰基烷基、 (C_1-C_6) -羟基烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_2-C_6) -烯氧基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -卤代烯氧基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -卤代烯基、 (C_2-C_6) -氰基烯基、 (C_2-C_6) -炔基、 (C_2-C_6) -炔氧基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -卤代炔氧基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -卤代炔基、 (C_2-C_6) -氰基炔基、 (C_3-C_8) -环烷基、 (C_3-C_8) -环烷基- (C_3-C_8) -环烷基、 (C_1-C_6) -烷基- (C_3-C_8) -环烷基、卤代- (C_3-C_8) -环烷基、氨基、 (C_1-C_6) -烷基氨基、二- (C_1-C_6) -烷基氨基、 (C_3-C_8) -环烷基氨基、 (C_1-C_6) -烷基羰基氨基、 (C_1-C_6) -烷硫基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷硫基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷基亚磺酰基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基亚磺酰基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷基磺酰基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基磺酰基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基- (C_1-C_6) -烷硫基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基- (C_1-C_6) -烷基亚磺酰基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基- (C_1-C_6) -烷基磺酰基- (C_1-C_6) -烷基、

(C₁-C₆)-烷基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基羰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基氨基、氨基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基氨基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基、二-(C₁-C₆)-烷基氨基磺酰基-(C₁-C₆)-烷基，

[0011] 或表示在每种情况下任选地被相同或不同的芳基、杂芳基或杂环基取代基单取代或多取代的以下基团：(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₃-C₈) 环烷基，其中芳基、杂芳基或杂环基在每种情况下可任选地被以下相同或不同的取代基单取代或多取代：卤素、氰基、硝基、羟基、氨基、羧基、氨基甲酰基、氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰亚胺基 ((C₁-C₆) alkylsulphimino)、(C₁-C₆) 烷基磺酰亚胺基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰亚胺基-(C₂-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰亚胺基 ((C₁-C₆) alkylsulphoximino)、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰亚胺基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰亚胺基-(C₂-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₃-C₆) 三烷基甲硅烷基或苄基或

[0012] R¹表示芳基、杂芳基或杂环基，这些基团中的每一个任选地被相同或不同的选自以下的取代基单取代或多取代：卤素、氰基、硝基、羟基、氨基、羧基、氨基甲酰基、(C₁-C₆) 烷基、(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰亚胺基、(C₁-C₆) 烷基磺酰亚胺基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰亚胺基-(C₂-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰亚胺基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰亚胺基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰亚胺基-(C₂-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₃-C₆) 三烷基甲硅烷基、(=O) (仅在杂环基的情况下) 和 (=O)₂ (仅在杂环基的情况下)，

[0013] R²表示任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代的饱和环、部分饱和环或杂芳环，其中至少一个碳原子被杂原子替代，其中在每种情况下可含有至少一个羰基基团和/或其中可能的取代基在每种情况下为：氢、氰基、羧基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三-(C₁-C₆) 烷基甲硅烷基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷基、(C₁-C₆) 氰基烷基、(C₁-C₆) 羟基烷基、羟基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 卤代烯基、(C₂-C₆) 氰基烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₂-C₆) 卤代炔基、(C₂-C₆) 氰基炔基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₃-C₆) 环烷基-(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷基-(C₃-C₆) 环烷基 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 氰基烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、-N=C(H)-O(C₁-C₆) 烷基、-C(H)=N-O(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 卤代烷硫基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷硫基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基-(C₁-C₆) 烷基磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₆) 烷基-氨基羰基、(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、二-(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、(C₃-C₆) 环烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆) 烷基氨基、二-(C₁-C₆)

烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰亚胺基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基、(C₁-C₆) 烷基羰基氨基，

[0014] R²还表示选自以下的基团：-C(=O)-R⁸(G1)、-C(=S)-R⁸(G2)、-C(=O)-NR¹¹R¹²(G3)、-C(=S)-NR¹¹R¹²(G4)、-S(O)_m-R¹³(G5)、-S=O(=NH)-R¹³(G6)、-S=O(=N-CN)-R¹³(G7)、-S(=N-CN)-R¹³(G8)、-S(O)₂-NR¹¹R¹²(G9)、-NR¹¹R¹²(G10)、-NR¹¹-NR¹¹R¹²(G11)、-NR¹¹-C(=O)-R⁸(G12)、-NR¹¹-C(=S)-R⁸(G13)、-NR¹¹-S(O)₂-R¹³(G14)、-N(R¹¹)-O-R¹³(G15)、-N=S(=O)_p-R¹⁴R¹⁵(G16)、-O-R¹³(G17)或-CR¹¹=N-OR¹³(G18)，其中如果R²表示G5、G6、G7、G8、G9，则n表示2，

[0015] R³表示氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三(C₁-C₆) 烷基甲硅烷基、(C₃-C₈) 环烷基、(C₃-C₈) 环烷基-(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基-(C₃-C₈) 环烷基、卤代(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷基、(C₁-C₆) 氰基烷基、(C₁-C₆) 羟基烷基、羟基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 卤代烯基、(C₂-C₆) 氰基烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₂-C₆) 卤代炔基、(C₂-C₆) 氰基炔基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 氰基烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 卤代烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 卤代烷硫基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷硫基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基硫代羰基、(C₁-C₆) 卤代烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、二-(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆) 烷基氨基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰亚胺基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基-氨基硫代羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基、NHC(O)-(C₁-C₆) 烷基((C₁-C₆) 烷基羰基氨基)，

[0016] 表示芳基或杂芳基，这些基团中的每一个任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代，其中(在杂芳基的情况下)可任选地存在至少一个羰基基团和/或其中可能的取代基在每种情况下为：氰基、羧基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三(C₁-C₆) 烷基甲硅烷基、(C₃-C₈) 环烷基、(C₃-C₈) 环烷基-(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基-(C₃-C₈) 环烷基、卤代(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷基、(C₁-C₆) 氰基烷基、(C₁-C₆) 羟基烷基、羟基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 卤代烯基、(C₂-C₆) 氰基烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₂-C₆) 卤代炔基、(C₂-C₆) 氰基炔基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 氰基烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 卤代烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 卤代烷硫基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷硫基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基亚

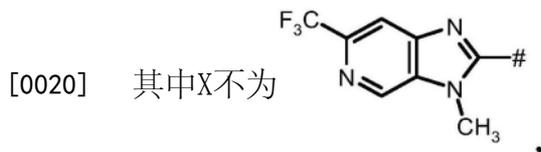
磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、二-(C₂-C₆)-烯基氨基羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆) 烷基氨基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰亚胺基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基、(C₁-C₆) 烷基羰基氨基，

[0017] R⁴表示氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三(C₁-C₆) 烷基甲硅烷基、(C₃-C₈) 环烷基、(C₃-C₈) 环烷基-(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基-(C₃-C₈) 环烷基、卤代(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷基、(C₁-C₆) 氰基烷基、(C₁-C₆) 羟基烷基、羟基羰基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 卤代烯基、(C₂-C₆) 氰基烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₂-C₆) 卤代炔基、(C₂-C₆) 氰基炔基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 氰基烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 卤代烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 卤代烷硫基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷硫基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基硫代羰基、(C₁-C₆) 卤代烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、二-(C₂-C₆)-烯基氨基羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆) 烷基氨基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰亚胺基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基、NHC(=O)-(C₁-C₆) 烷基((C₁-C₆) 烷基羰基氨基)，

[0018] X表示部分不饱和或饱和的杂环或杂芳族8元、9元、10元、11元或12元稠合的双环或三环环体系，其中任选地可存在至少一个羰基基团和/或其中环体系任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代，且其中所述取代基可彼此独立地选自氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三(C₁-C₆) 烷基甲硅烷基、(C₃-C₈) 环烷基、(C₃-C₈) 环烷基-(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基-(C₃-C₈) 环烷基、卤代(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷基、(C₁-C₆) 氰基烷基、(C₁-C₆) 羟基烷基、羟基羰基-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 卤代烯基、(C₂-C₆) 氰基烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₂-C₆) 炔氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₆) 卤代炔基、(C₂-C₆) 氰基炔基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 卤代烯氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 氰基烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷基-(C₁-C₆) 烷

氧基亚氨基、(C₁-C₆) 卤代烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 卤代烷硫基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷硫基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基硫代羰基、(C₁-C₆) 卤代烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、二-(C₂-C₆) 烯基氨基羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆) 烷基氨基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰亚氨基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基、NHC(O)-(C₁-C₆) 烷基((C₁-C₆) 烷基羰基氨基)，

[0019] 或其中取代基可彼此独立地选自苯基或5元或6元杂芳族环，其中苯基或所述环可任选地被相同或不同的选自以下的取代基单取代或多取代：C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₂-C₆-卤代烯基、C₂-C₆-卤代炔基、C₃-C₆-卤代环烷基、卤素、CN、NO₂、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基，



[0021] R⁸表示氢或表示在每种情况下任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代的以下基团：C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₁-C₄-烷氧基、C₃-C₁₂-环烷基、C₃-C₁₂-环烷基-C₁-C₆-烷基或C₄-C₁₂-双环烷基，其中所述取代基可彼此独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰亚胺基、C₁-C₄-烷基磺酰亚胺基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基磺酰亚胺基-C₂-C₅-烷基羰基、C₁-C₄-烷基亚磺酰亚胺基、C₁-C₄-烷基亚磺酰亚胺基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基亚磺酰亚胺基-C₂-C₅-烷基羰基、C₂-C₆-烷氧基羰基、C₂-C₆-烷基羰基、C₃-C₆-三烷基甲硅烷基、氨基、C₁-C₄-烷基氨基、二-(C₁-C₄-烷基)氨基、C₃-C₆-环烷基氨基、苯环或3元至6元芳族、部分饱和或饱和的杂环，其中苯环或杂环在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代，且其中所述取代基可彼此独立地选自C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₂-C₆-卤代烯基、C₂-C₆-卤代炔基、C₃-C₆-卤代环烷基、卤素、CN、(C=O)OH、CONH₂、NO₂、OH、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-卤代烷硫基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、C₁-C₄-烷基氨基、二-(C₁-C₄-烷基)氨基、C₃-C₆-环烷基氨基、(C₁-C₆-烷基)羰基、(C₁-C₆-烷氧基)羰基、(C₁-C₆-烷基)氨基羰基、二-(C₁-C₄-烷基)氨基羰基、三-(C₁-C₂)烷基甲硅烷基、(C₁-C₄-烷基)(C₁-C₄-烷氧基)亚氨基，或

[0022] R⁸表示苯环或3元至6元芳族、部分饱和或饱和的杂环，其中杂原子选自N、S、O，其中苯环或杂环在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代，且其中所述取代基可彼此独立地选自C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-卤代烷

基、C₂-C₆-卤代烯基、C₂-C₆-卤代炔基、C₃-C₆-卤代环烷基、卤素、CN、(C=O)OH、CONH₂、NO₂、OH、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-卤代烷硫基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、C₁-C₄-烷基氨基、二-(C₁-C₄-烷基)氨基、C₃-C₆-环烷基氨基、(C₁-C₆-烷基)羰基、(C₁-C₆-烷氧基)羰基、(C₁-C₆-烷基)氨基羰基、二-(C₁-C₄-烷基)氨基羰基、三-(C₁-C₂)烷基甲硅烷基、(C₁-C₄-烷基)(C₁-C₄-烷氧基)亚氨基,或

[0023] R₁₃、R₁₄、R₁₅彼此独立的表示在每种情况下任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代的以下基团:C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₁₂-环烷基、C₃-C₁₂-环烷基-C₁-C₆-烷基或C₄-C₁₂-二环烷基,其中所述取代基可彼此独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰亚胺基、C₁-C₄-烷基磺酰亚胺基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基磺酰亚胺基-C₂-C₅-烷基羰基、C₁-C₄-烷基亚磺酰亚胺基、C₁-C₄-烷基亚磺酰亚胺基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基亚磺酰亚胺基-C₂-C₅-烷基羰基、C₂-C₆-烷氧基羰基、C₂-C₆-烷基羰基、C₃-C₆-三烷基甲硅烷基、氨基、C₁-C₄-烷基氨基、二-(C₁-C₄-烷基)氨基、C₃-C₆-环烷基氨基、苯环或3元或6元芳族、部分饱和或饱和的杂环,其中苯环或杂环在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代,且其中所述取代基可彼此独立地选自C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₂-C₆-卤代烯基、C₂-C₆-卤代炔基、C₃-C₆-卤代环烷基、卤素、氰基、(C=O)OH、CONH₂、NO₂、OH、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-卤代烷硫基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、C₁-C₄-烷基氨基、二-(C₁-C₄-烷基)氨基、C₃-C₆-环烷基氨基、(C₁-C₆-烷基)羰基、(C₁-C₆-烷氧基)羰基、(C₁-C₆-烷基)氨基羰基、二-(C₁-C₄-烷基)氨基羰基、三-(C₁-C₂)烷基甲硅烷基、(C₁-C₄-烷基)(C₁-C₄-烷氧基)亚氨基,

[0024] R¹³、R¹⁴、R¹⁵彼此独立地表示苯环或3元至6元芳族、部分饱和或饱和的杂环,其中杂原子选自N、S、O,其中苯环或杂环在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代,且其中所述取代基可彼此独立地选自C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₂-C₆-卤代烯基、C₂-C₆-卤代炔基、C₃-C₆-卤代环烷基、卤素、氰基、(C=O)OH、CONH₂、NO₂、OH、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-烷硫基、C₁-C₄-烷基亚磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-卤代烷硫基、C₁-C₄-卤代烷基亚磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、二-(C₁-C₄-烷基)氨基、C₃-C₆-环烷基氨基、(C₁-C₆-烷基)羰基、(C₁-C₆-烷氧基)羰基、(C₁-C₆-烷基)氨基羰基、二-(C₁-C₄-烷基)氨基羰基、三-(C₁-C₂)烷基甲硅烷基、(C₁-C₄-烷基)(C₁-C₄-烷氧基)亚氨基,

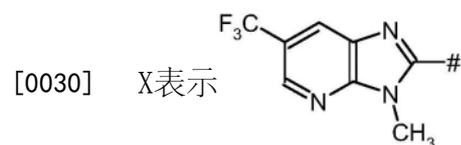
[0025] R¹¹、R¹²彼此独立地表示氢或表示R¹³,

[0026] m表示0、1或2,

[0027] n表示0、1或2,

[0028] p表示0或1,

[0029] 排除式(I)的化合物,其中



[0031] 且 A^1 表示N或CH, R^1 表示乙基, R^2 表示S-甲基, R^3 表示氢且n表示0

[0032] 或 A^1 表示N或CH, R^1 表示乙基, R^2 表示O-甲基, R^3 表示氢且n表示0、1或2。

[0033] 构型1-2:

[0034] A^1 、 R^1 、 R^3 、 R^4 、X、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、m、n和p具有构型1-1中给出的含义且

[0035] R^2 表示任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代的饱和杂环、部分饱和杂环或杂芳族环,其中至少一个碳原子被杂原子替代,其中在每种情况下任选地可存在至少一个羰基基团和/或其中可能的取代基在每种情况下为:氢、氰基、羧基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三-(C_1-C_6)烷基甲硅烷基、(C_1-C_6)烷基、(C_1-C_6)卤代烷基、(C_1-C_6)氰基烷基、(C_1-C_6)羟基烷基、羟基羰基-(C_1-C_6)-烷氧基、(C_1-C_6)烷氧基羰基-(C_1-C_6)烷基、(C_1-C_6)烷氧基-(C_1-C_6)烷基、(C_2-C_6)烯基、(C_2-C_6)卤代烯基、(C_2-C_6)氰基烯基、(C_2-C_6)炔基、(C_2-C_6)卤代炔基、(C_2-C_6)氰基炔基、(C_3-C_6)环烷基、(C_3-C_6)环烷基-(C_3-C_6)环烷基、(C_1-C_4)烷基-(C_3-C_6)环烷基(C_1-C_6)烷氧基、(C_1-C_6)卤代烷氧基、(C_1-C_6)氰基烷氧基、(C_1-C_6)烷氧基羰基-(C_1-C_6)烷氧基、(C_1-C_6)烷氧基-(C_1-C_6)烷氧基、(C_1-C_6)烷氧基亚氨基、-N=C(H)-O(C_1-C_6)烷基、-C(H)=N-O(C_1-C_6)烷基、(C_1-C_6)卤代烷基-(C_1-C_6)烷氧基亚氨基、(C_1-C_6)烷硫基、(C_1-C_6)卤代烷硫基、(C_1-C_6)烷氧基-(C_1-C_6)烷硫基、(C_1-C_6)烷硫基-(C_1-C_6)烷基、(C_1-C_6)烷基亚磺酰基、(C_1-C_6)卤代烷基亚磺酰基、(C_1-C_6)烷氧基-(C_1-C_6)烷基亚磺酰基、(C_1-C_6)烷基亚磺酰基-(C_1-C_6)烷基、(C_1-C_6)烷基磺酰基、(C_1-C_6)卤代烷基磺酰基、(C_1-C_6)烷氧基-(C_1-C_6)烷基磺酰基、(C_1-C_6)烷基磺酰基-(C_1-C_6)烷基、(C_1-C_6)烷基磺酰基氧基、(C_1-C_6)烷基羰基、(C_1-C_6)卤代烷基羰基、(C_1-C_6)烷基羰基氧基、(C_1-C_6)烷氧基羰基、(C_1-C_6)卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C_1-C_6)烷基氨基羰基、二-(C_1-C_6)烷基氨基羰基、(C_2-C_6)烯基氨基羰基、二-(C_2-C_6)-烯基氨基羰基、(C_3-C_8)环烷基氨基羰基、(C_1-C_6)烷基磺酰基氨基、(C_1-C_6)烷基氨基、二-(C_1-C_6)烷基氨基、氨基磺酰基、(C_1-C_6)烷基氨基磺酰基、二-(C_1-C_6)烷基氨基磺酰基、(C_1-C_6)烷基亚磺酰亚胺基、氨基硫代羰基、(C_1-C_6)烷基氨基硫代羰基、二-(C_1-C_6)烷基氨基硫代羰基、(C_3-C_6)环烷基氨基、(C_1-C_6)烷基羰基氨基,

[0036] R^2 还表示选自以下的基团:-C(=O)- R^8 (G1)、-C(=S)- R^8 (G2)、-C(=O)- $NR^{11}R^{12}$ (G3)、-C(=S)- $NR^{11}R^{12}$ (G4)、-S(O)_m- R^{13} (G5)、-S=O(=NH)- R^{13} (G6)、-S=O(=N-CN)- R^{13} (G7)、-S(=N-CN)- R^{13} (G8)、-S(O)₂- $NR^{11}R^{12}$ (G9)、- $NR^{11}R^{12}$ (G10)、- NR^{11} - $NR^{11}R^{12}$ (G11)、- NR^{11} -C(=O)- R^8 (G12)、- NR^{11} -C(=S)- R^8 (G13)、- NR^{11} -S(O)₂- R^{13} (G14)、-N(R^{11})-O- R^{13} (G15)、-N=S(=O)_p- $R^{14}R^{15}$ (G16)、-O- R^{13} (G17)、-CR¹¹=N-OR¹³(G18)或-CR¹¹=CR⁸R¹²G(19),其中如果 R^2 表示G5、G6、G7、G8、G9,则n表示2,

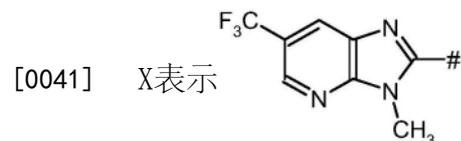
[0037] R^8 表示氢或表示在每种情况下任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代的以下基团:氨基、 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_3-C_{12} -环烷基、 C_3-C_{12} -环烷基- C_1-C_6 -烷基或 C_4-C_{12} -二环烷基,其中所述取代基可彼此独立地选自卤素、氰基、硝基、羟基、 C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰亚胺基、 C_1-C_4 -烷基磺酰亚胺基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基磺酰亚胺基- C_2-C_5 -烷基羰基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰亚胺基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰亚胺基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰亚胺基- C_2-C_5 -烷基羰基、 C_2-C_6 -烷氧基羰基、 C_2-C_6 -烷基羰基、 C_3-C_6 -三烷基甲硅烷基、氨基、 C_1-C_4 -烷基氨基、二-(C_1-C_4 -烷基)氨基、 C_3-C_6 -环烷基氨基、苯环或3元至6元芳族、部分饱和或饱和的杂环,其中苯环或杂环在每种情况下可任选

地被相同或不同的取代基单取代或多取代,且其中所述取代基可彼此独立地选自 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_2-C_6 -卤代烯基、 C_2-C_6 -卤代炔基、 C_3-C_6 -卤代环烷基、卤素、CN、(C=O)OH、CONH₂、NO₂、OH、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷硫基、 C_1-C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基、 C_1-C_4 -烷基氨基、二(C_1-C_4 -烷基)氨基、 C_3-C_6 -环烷基氨基、(C_1-C_6 -烷基)羰基、(C_1-C_6 -烷氧基)羰基、(C_1-C_6 -烷基)氨基羰基、二- (C_1-C_4 -烷基)氨基羰基、三- (C_1-C_2) 烷基甲硅烷基、(C_1-C_4 -烷基) (C_1-C_4 -烷氧基) 亚氨基,或

[0038] R^8 表示苯环或3元至6元芳族、部分饱和或饱和的杂环,其中杂原子选自N、S、O,其中苯环或杂环在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代,且其中所述取代基可彼此独立地选自 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_2-C_6 -卤代烯基、 C_2-C_6 -卤代炔基、 C_3-C_6 -卤代环烷基、卤素、CN、(C=O)OH、CONH₂、NO₂、OH、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷硫基、 C_1-C_4 -卤代烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基、 C_1-C_4 -烷基氨基、二- (C_1-C_4 -烷基)氨基、 C_3-C_6 -环烷基氨基、(C_1-C_6 -烷基)羰基、(C_1-C_6 -烷氧基)羰基、(C_1-C_6 -烷基)氨基羰基、二- (C_1-C_4 -烷基)氨基羰基、三- (C_1-C_2) 烷基甲硅烷基、(C_1-C_4 -烷基) (C_1-C_4 -烷氧基) 亚氨基,

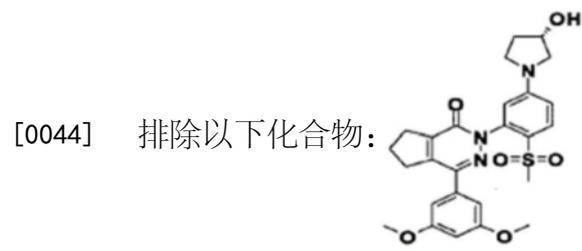
[0039] 其中如果 R^2 表示任选取代的Q45,则X不为H1、H2或H4,如果 R^2 表示G10、G11、G12、G13、G14、G15或G16且 A^1 表示N,则X不表示H1、H2、H4、H5、H7、H8或H14,

[0040] 排除式(I)的化合物,其中



[0042] 且 A^1 表示N或CH, R^1 表示乙基, R^2 表示S-甲基, R^3 表示氢且n表示0

[0043] 或 A^1 表示N或CH, R^1 表示乙基, R^2 表示O-甲基, R^3 表示氢且n表示0、1或2,



[0045] 另外还发现,式(I)的化合物作为农药,优选作为杀虫剂和/或杀螨剂具有非常好的功效,并且另外通常具有非常好的植物相容性,特别是对作物植物而言。

[0046] 式(I)提供了本发明化合物的一般定义。在上文和下文提及的式中给出的优选的取代基或基团的范围在下文中举例说明:

[0047] 构型2-1:

[0048] A^1 优选表示氮、 $=N^+-O^-$ 或 $=C-R^4$,

[0049] R^1 优选表示(C_1-C_4)烷基、(C_1-C_4)羟基烷基、(C_1-C_4)卤代烷基、(C_1-C_4)氰基烷基、(C_1-C_4)烷氧基- (C_1-C_4)烷基、(C_1-C_4)卤代烷氧基- (C_1-C_4)烷基、(C_2-C_4)烯基、(C_2-C_4)烯氧基- (C_1-C_4)烷基、(C_2-C_4)卤代烯氧基- (C_1-C_4)烷基、(C_2-C_4)卤代烯基、(C_2-C_4)氰基烯基、(C_2-

C_4 炔基、 (C_2-C_4) 炔氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 卤代炔氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 卤代炔基、 (C_2-C_4) 氰基炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基- (C_3-C_6) 环烷基、卤代 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基氨基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基、 (C_3-C_6) 环烷基氨基、 (C_1-C_4) 烷基羰基氨基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷硫基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基羰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基羰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氨基，

[0050] 或表示 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -炔基、 (C_3-C_6) -环烷基，这些基团中的每一个任选地被选自以下的相同或不同的取代基单取代或双取代：芳基、杂芳基和杂环基，其中芳基、杂芳基和杂环基在每种情况下可任选地被相同或不同的选自以下的取代基单取代或双取代：卤素、氰基、氨基甲酰基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷硫基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰亚胺基，或

[0051] R^1 优选表示芳基、杂芳基或杂环基，这些基团中的每一个任选地被选自以下的相同或不同的取代基单取代或双取代：卤素、氰基、氨基甲酰基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷硫基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰亚胺基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰亚胺基、 (C_1-C_4) -烷基羰基、 (C_3-C_4) -三烷基甲硅烷基、 $(=O)$ (仅在杂环基的情况下) 和 $(=O)_2$ (仅在杂环基的情况下)，

[0052] R^2 优选表示饱和环、部分饱和环或杂芳族环，其任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代，其中至少一个碳原子被选自N、O和S的杂原子取代，其中在每种情况下任选地可存在至少一个羰基基团和/或其中在每种情况下可能的取代基为：氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、氨基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 氰基烷基、 (C_1-C_4) 羟基烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 卤代烯基、 (C_2-C_4) 氰基烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_2-C_4) 卤代炔基、 (C_2-C_4) 氰基炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) 氰基烷氧基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷氧基亚氨基、 $-N=C(H)-O$ (C_1-C_4) 烷基、 $-C(H)=N-O$ (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基- (C_1-C_4) 烷氧基亚氨基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 卤代烷硫基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氧基、 (C_1-C_4) 烷基羰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基羰基、氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氨基、 (C_1-C_4) 烷基氨基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基羰基氨基，

[0053] R^2 还优选表示选自以下的基团 $-C(=O)-R^8$ (G1)、 $-C(=S)-R^8$ (G2)、 $-C(=O)-NR^{11}R^{12}$ (G3)、 $-C(=S)-NR^{11}R^{12}$ (G4)、 $-S=O(=NH)-R^{13}$ (G6)、 $-S=O(=N-CN)-R^{13}$ (G7)、 $-S(=N-CN)-R^{13}$ (G8)、 $-S(O)_2-NR^{11}R^{12}$ (G9)、 $-NR^{11}R^{12}$ (G10)、 $-NR^{11}-NR^{11}R^{12}$ (G11)、 $-NR^{11}-C(=O)-R^8$ (G12)、 $-NR^{11}-C(=S)-R^8$ (G13)、 $-NR^{11}-S(O)_2-R^{13}$ (G14)、 $-N(R^{11})-O-R^{13}$ (G15)、 $-N=S(=O)_p-R^{14}R^{15}$ (G16) 或 $-CR^{11}=N-OR^{13}$ (G18)，其中如果 R^2 表示G6、G7、G8、G9，则n表示2，

[0054] R^3 优选表示氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三(C₁-C₄) 烷基甲硅烷基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₃-C₆) 环烷基-(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷基-(C₃-C₆) 环烷基、卤代(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 氰基烷基、(C₁-C₄) 羟基烷基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 烯基、(C₂-C₄) 卤代烯基、(C₂-C₄) 氰基烯基、(C₂-C₄) 炔基、(C₂-C₄) 卤代炔基、(C₂-C₄) 氰基炔基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 卤代烷氧基、(C₁-C₄) 氰基烷氧基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷基-(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 卤代烷基-(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷硫基、(C₁-C₄) 卤代烷硫基、(C₁-C₄) 烷硫基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₄) 烷基羰基、(C₁-C₄) 卤代烷基羰基、氨基羰基、氨基硫代羰基、(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₄) 烷基氨基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、氨基硫代羰基、NHC(=O)-(C₁-C₄) 烷基((C₁-C₄) 烷基羰基氨基)，

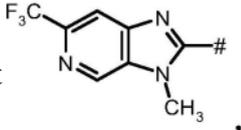
[0055] 还优选表示苯基或杂芳基，这些基团中的每一个任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代，其中(在杂芳基的情况下)可任选地存在至少一个羰基基团和/或其中在每种情况下可能的取代基为：氰基、卤素、硝基、乙酰基、氨基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₃-C₆) 环烷基-(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷基-(C₃-C₆) 环烷基、卤代(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 氰基烷基、(C₁-C₄) 羟基烷基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 烯基、(C₂-C₄) 卤代烯基、(C₂-C₄) 氰基烯基、(C₂-C₄) 炔基、(C₂-C₄) 卤代炔基、(C₂-C₄) 氰基炔基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 卤代烷氧基、(C₁-C₄) 氰基烷氧基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷基-(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 卤代烷基-(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷硫基、(C₁-C₄) 卤代烷硫基、(C₁-C₄) 烷硫基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₄) 烷基羰基、(C₁-C₄) 卤代烷基羰基、氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₄) 烷基氨基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、NHC(=O)-(C₁-C₄) 烷基((C₁-C₄) 烷基羰基氨基)，

[0056] R^4 优选表示氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三(C₁-C₄) 烷基甲硅烷基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₃-C₆) 环烷基-(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷基-(C₃-C₆) 环烷基、卤代(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 氰基烷基、(C₁-C₄) 羟基烷基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₄) 烯基、(C₂-C₄) 卤代烯基、(C₂-C₄) 氰基烯基、(C₂-C₄) 炔基、(C₂-C₄) 卤代炔基、(C₂-C₄) 氰基炔基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 卤代烷氧基、(C₁-C₄) 氰基烷氧基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷基-(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 卤代烷基-(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷硫基、(C₁-C₄) 卤代烷硫基、(C₁-C₄) 烷硫基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₄) 烷基羰基、(C₁-C₄) 卤代烷基羰基、氨基羰基、氨基硫代羰基、(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基

基氨基、(C₁-C₄) 烷基氨基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、氨基硫代羰基、NHC(O)-(C₁-C₄) 烷基((C₁-C₄) 烷基羰基氨基)，

[0057] X 优选表示杂芳族 8 元、9 元、10 元、11 元或 12 元稠合的双环或三环环体系，其中所述环体系任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代，且其中所述取代基可彼此独立地选自氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、羟基、氨基、SCN、三-(C₁-C₆) 烷基甲硅烷基、(C₃-C₈) 环烷基、(C₃-C₈) 环烷基-(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基-(C₃-C₈) 环烷基、卤代(C₃-C₈) 环烷基、(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 卤代烷基、(C₁-C₆) 氰基烷基、(C₁-C₆) 羟基烷基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 卤代烯基、(C₂-C₆) 氰基烯基、(C₂-C₆) 炔基、(C₂-C₆) 炔氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₂-C₆) 卤代炔基、(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 卤代烯氧基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 氰基烷氧基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷基羟基亚氨基、(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷基-(C₁-C₆) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 卤代烷硫基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷硫基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷氧基-(C₁-C₆) 烷基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₆) 烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基-(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷基硫代羰基、(C₁-C₆) 卤代烷基羰基、(C₁-C₆) 烷基羰基氧基、(C₁-C₆) 烷氧基羰基、(C₁-C₆) 卤代烷氧基羰基、氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基羰基、(C₁-C₆) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₆) 烷基氨基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基磺酰基、(C₁-C₆) 烷基亚磺酰基、氨基硫代羰基、(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、二-(C₁-C₆) 烷基氨基硫代羰基、(C₃-C₈) 环烷基氨基、NHC(O)-(C₁-C₆) 烷基((C₁-C₆) 烷基羰基氨基)，

[0058] 或其中取代基可彼此独立地选自苯基或 5 元或 6 元杂芳族环，其中苯基或所述环可任选地被相同或不同的选自以下的取代基单取代或多取代：C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₆-环烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₂-C₆-卤代烯基、C₂-C₆-卤代炔基、C₃-C₆-卤代环烷基、卤素、CN、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基，

[0059] 其中 X 不是 

[0060] R⁸ 优选表示氢，表示 C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基，或 C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基，这些基团中的每一个任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代，其中所述取代基可彼此独立地选自卤素、氰基、苯环和 3 元至 6 元芳族、部分饱和或饱和的杂环，其中苯环或杂环在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代，且其中取代基可彼此独立地选自 C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、卤素、氰基、NO₂、C₁-C₄-烷氧基和 C₁-C₄-卤代烷氧基，或

[0061] R⁸ 优选表示苯环或 3 元至 6 元芳族、部分饱和或饱和的杂环，其中杂原子选自 N、S 和 O，其中苯环或杂环在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代，且其中取代基可彼此独立地选自 C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、卤素或氰基，

[0062] R¹³、R¹⁴、R¹⁵ 优选彼此独立地表示 C₁-C₄-烷基或 C₃-C₆-环烷基，这些基团中的每一个

任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代,其中取代基可彼此独立地选自卤素、氰基、苯环或3元至6元芳族、部分饱和或饱和的杂环,其中苯环或杂环在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代,且其中取代基可彼此独立地选自 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、卤素、氰基、 NO_2 、 C_1-C_4 -烷氧基和 C_1-C_4 -卤代烷氧基,或

[0063] R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 优选彼此独立地表示苯环或3元至6元芳族、部分饱和或饱和的杂环,其中杂原子选自N、S和O,其中苯环或杂环在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代,且其中取代基可彼此独立地选自 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、卤素或氰基,

[0064] R^{11} 、 R^{12} 优选彼此独立地表示氢或表示 R^{13} ,

[0065] n优选表示0、1或2,

[0066] p优选表示0或1。

[0067] 构型2-2:

[0068] A^1 、 R^1 、 R^3 、 R^4 、X、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、n和p具有构型2-1中给出的含义且

[0069] R^2 优选表示饱和杂环、部分饱和杂环或杂芳族环,其任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代,其中至少一个碳原子被选自N、O和S的杂原子替代,其中在每种情况下任选地可存在至少一个羰基基团和/或其中可能的取代基在每种情况下为:氢、氰基、卤素、硝基、乙酰基、氨基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 氰基烷基、 (C_1-C_4) 羟基烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 卤代烯基、 (C_2-C_4) 氰基烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_2-C_4) 卤代炔基、 (C_2-C_4) 氰基炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) 氰基烷氧基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷氧基亚氨基、 $-N=C(H)-O(C_1-C_4)$ 烷基、 $-C(H)=N-O(C_1-C_4)$ 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基- (C_1-C_4) 烷氧基亚氨基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 卤代烷硫基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氧基、 (C_1-C_4) 烷基羰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基羰基、氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氨基、 (C_1-C_4) 烷基氨基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基羰基氨基,

[0070] R^2 还优选表示选自以下的基团: $-C(=O)-R^8$ (G1)、 $-C(=S)-R^8$ (G2)、 $-C(=O)-NR^{11}R^{12}$ (G3)、 $-C(=S)-NR^{11}R^{12}$ (G4)、 $-S=O(=NH)-R^{13}$ (G6)、 $-S=O(=N-CN)-R^{13}$ (G7)、 $-S(=N-CN)-R^{13}$ (G8)、 $-S(O)_2-NR^{11}R^{12}$ (G9)、 $-NR^{11}R^{12}$ (G10)、 $-NR^{11}-NR^{11}R^{12}$ (G11)、 $-NR^{11}-C(=O)-R^8$ (G12)、 $-NR^{11}-C(=S)-R^8$ (G13)、 $-NR^{11}-S(O)_2-R^{13}$ (G14)、 $-N(R^{11})-O-R^{13}$ (G15)、 $-N=S(=O)_p-R^{14}R^{15}$ (G16)、 $-CR^{11}=N-OR^{13}$ (G18)或 $-CR^{11}=CR^8R^{12}G$ (19),其中如果 R^2 表示G6、G7、G8、G9,则n表示2,

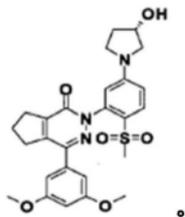
[0071] R^8 优选表示氢、氨基、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷硫基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基氨基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基,这些基团中的每一个任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代,其中所述取代基可彼此独立地选自卤素、氰基、苯环或3元至6元芳族、部分饱和或饱和的杂环,其中苯环或杂环在每种情况下可被相同或不同的取代基单取代或多取代,且其中所述取代基可彼此独立地选自 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、

卤素、氰基、NO₂、C₁-C₄-烷氧基或C₁-C₄-卤代烷氧基,或

[0072] R⁸优选表示苯环或3元至6元芳族、部分饱和或饱和的杂环,其中杂原子选自N、S和O,其中苯环或杂环在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或多取代,且其中所述取代基可彼此独立地选自C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、卤素或氰基,

[0073] 其中如果R²表示任选取代的Q45,则X不为H1、H2或H4,如果R²表示G10、G11、G12、G13、G14、G15或G16且A¹表示N,则X不表示H1、H2、H4、H5、H7、H8或H14,

[0074] 排除以下化合物:



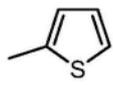
[0075] 构型3-1:

[0076] A¹特别优选表示氮或=C-R⁴,

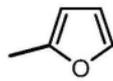
[0077] R¹特别优选表示(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-羟基烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-卤代烯基、(C₂-C₄)-炔基、(C₂-C₄)-卤代炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷硫基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基-(C₁-C₄)-烷基或(C₁-C₄)-烷基磺酰基-(C₁-C₄)-烷基,

[0078] R²特别优选表示选自任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代的Q1至Q99的5元或6元饱和的、部分饱和的或杂芳族环,其在每种情况下可含有至少一个羰基基团和/或其中可能的取代基在每种情况下为:氢、氰基、(C₁-C₄)-氰基烷基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、卤素、氨基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-卤代烯基、(C₂-C₄)-炔基、(C₂-C₄)-卤代炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷基-(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基、(C₁-C₄)-烷氧基亚氨基、-C(H)=N-(C₁-C₄)-烷基、(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-C₄)-烷基磺酰基氧基、(C₁-C₄)-烷基羰基、(C₁-C₄)-卤代烷基羰基、氨基羰基、(C₁-C₄)-烷基氨基羰基、二-(C₁-C₄)-烷基氨基羰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基氨基、(C₁-C₄)-烷基氨基、二-(C₁-C₄)-烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₄)-烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₄)-烷基氨基磺酰基、(C₁-C₄)-烷基羰基氨基,

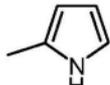
[0079]



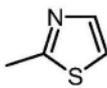
Q-1



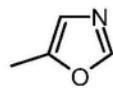
Q-2



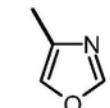
Q-3



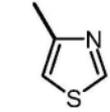
Q-4



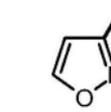
Q-5



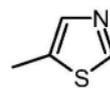
Q-6



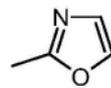
Q-7



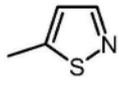
Q-8



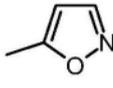
Q-9



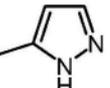
Q-10



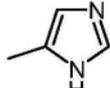
Q-11



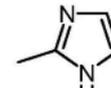
Q-12



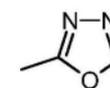
Q-13



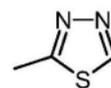
Q-14



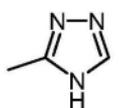
Q-15



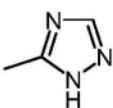
Q-16



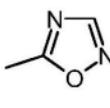
Q-17



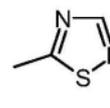
Q-18



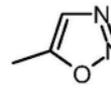
Q-19



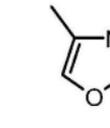
Q-20



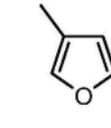
Q-21



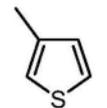
Q-22



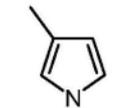
Q-23



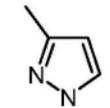
Q-24



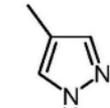
Q-25



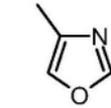
Q-26



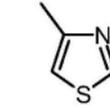
Q-27



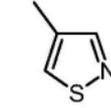
Q-28



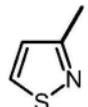
Q-29



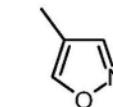
Q-30



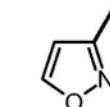
Q-31



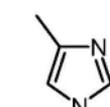
Q-32



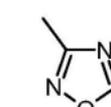
Q-33



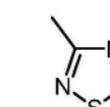
Q-34



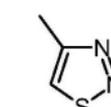
Q-35



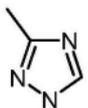
Q-36



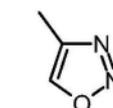
Q-37



Q-38



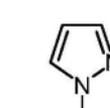
Q-39



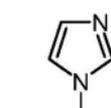
Q-40



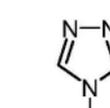
Q-41



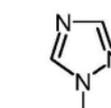
Q-42



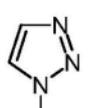
Q-43



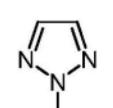
Q-44



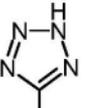
Q-45



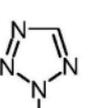
Q-46



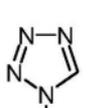
Q-47



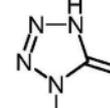
Q-48



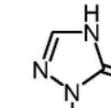
Q-49



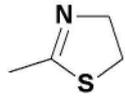
Q-50



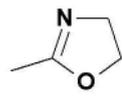
Q-51



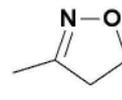
Q-52



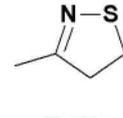
Q-53



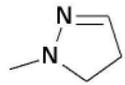
Q-54



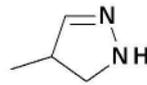
Q-55



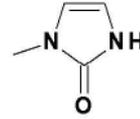
Q-56



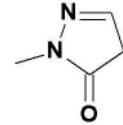
Q-57



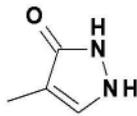
Q-58



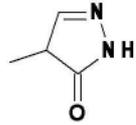
Q-59



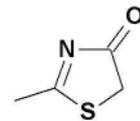
Q-60



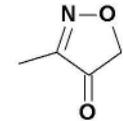
Q-61



Q-62

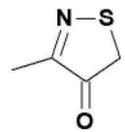


Q-63

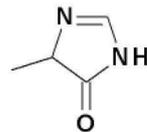


Q-64

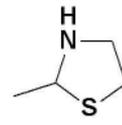
[0080]



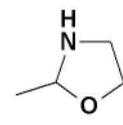
Q-65



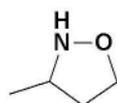
Q-66



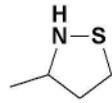
Q-67



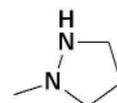
Q-68



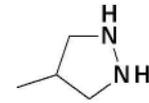
Q-69



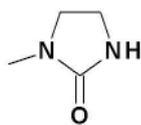
Q-70



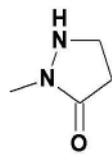
Q-71



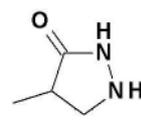
Q-72



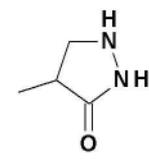
Q-73



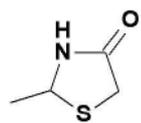
Q-74



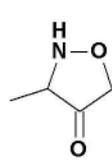
Q-75



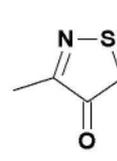
Q-76



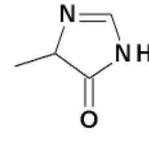
Q-77



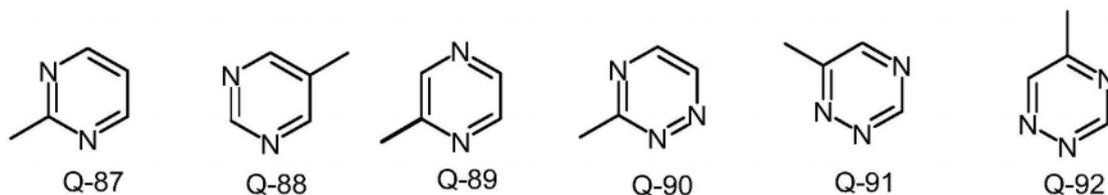
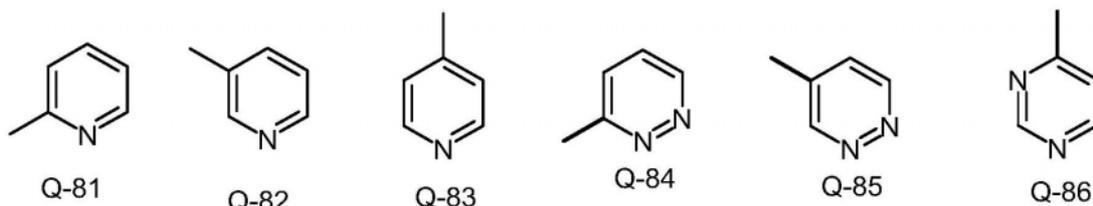
Q-78



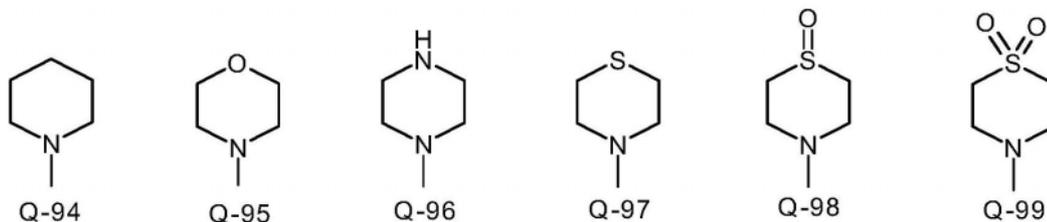
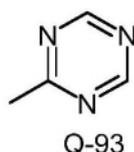
Q-79



Q-80



[0081]



[0082] R^2 还特别优选表示选自以下的基团:G1、G2、G3、G4、G6、G7、G8、G9、G10、G11、G12、G13、G14、G15、G16或G18,

[0083] 其中如果 R^2 表示G6、G7、G8、G9,则n表示2,

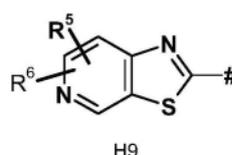
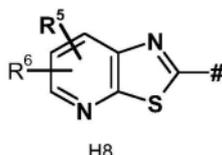
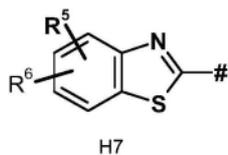
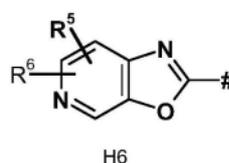
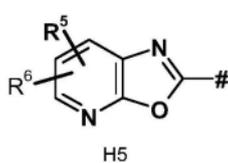
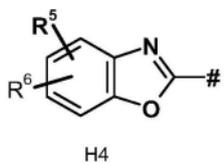
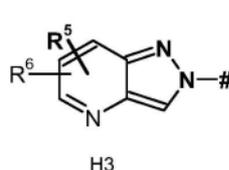
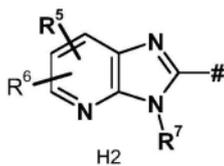
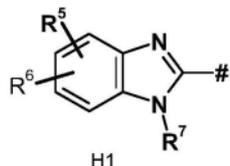
[0084] R^3 特别优选表示氢、氰基、卤素、硝基、羟基、氨基、SCN、三-(C_1-C_4)烷基甲硅烷基、(C_3-C_6)环烷基、(C_3-C_6)环烷基-(C_3-C_6)环烷基、(C_1-C_4)烷基-(C_3-C_6)环烷基、卤代(C_3-C_6)环烷基、(C_1-C_4)烷基、(C_1-C_4)卤代烷基、(C_1-C_4)氰基烷基、(C_1-C_4)烷氧基-(C_1-C_4)烷基、(C_2-C_4)烯基、(C_2-C_4)卤代烯基、(C_2-C_4)氰基烯基、(C_2-C_4)炔基、(C_2-C_4)卤代炔基、(C_2-C_4)氰基炔基、(C_1-C_4)烷氧基、(C_1-C_4)卤代烷氧基、(C_1-C_4)氰基烷氧基、(C_1-C_4)烷基羟基亚氨基、(C_1-C_4)烷氧基亚氨基、(C_1-C_4)烷基-(C_1-C_4)烷氧基亚氨基、(C_1-C_4)烷硫基、(C_1-C_4)卤代烷硫基、(C_1-C_4)烷基亚磺酰基、(C_1-C_4)卤代烷基亚磺酰基、(C_1-C_4)烷基磺酰基、(C_1-C_4)卤代烷基磺酰基、(C_1-C_4)烷基磺酰基氧基、(C_1-C_4)烷基羰基、(C_1-C_4)卤代烷基羰基、氨基羰基、(C_1-C_4)烷基氨基羰基、二-(C_1-C_4)烷基氨基羰基、(C_1-C_4)烷基磺酰基氨基、(C_1-C_4)烷基氨基、二-(C_1-C_4)烷基氨基、氨基磺酰基、(C_1-C_4)烷基氨基磺酰基、二-(C_1-C_4)烷基氨基磺酰基、NHC0-(C_1-C_4)烷基((C_1-C_4)烷基羰基氨基),

[0085] 还特别优选表示苯基或杂芳基,这些基团中的每一个任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代,其中(在杂芳基的情况下)可任选地存在至少一个羰基基团和/或其中在每种情况下可能的取代基为:氰基、卤素、(C_3-C_6)环烷基、(C_3-C_6)环烷基-(C_3-C_6)环烷基、(C_1-C_4)烷基-(C_3-C_6)环烷基、卤素(C_3-C_6)环烷基、(C_1-C_4)烷基、(C_1-C_4)卤代烷基、(C_1-C_4)氰基烷基、(C_2-C_4)烯基、(C_2-C_4)卤代烯基、(C_2-C_4)氰基烯基、(C_2-C_4)炔基、(C_2-C_4)卤代炔基、(C_2-C_4)氰基炔基、(C_1-C_4)烷氧基、(C_1-C_4)卤代烷氧基、(C_1-C_4)烷基羟基亚氨基、(C_1-C_4)烷

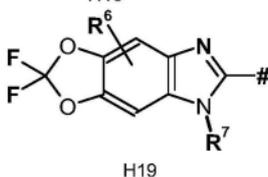
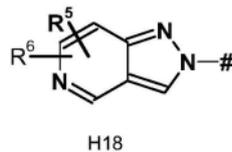
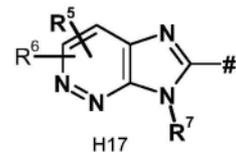
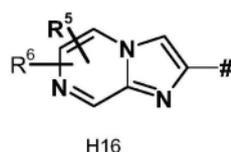
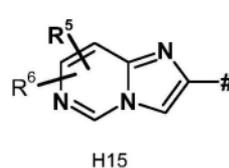
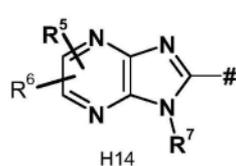
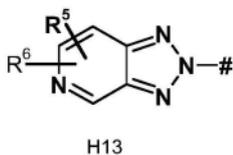
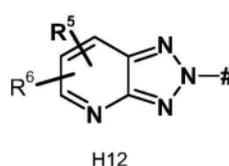
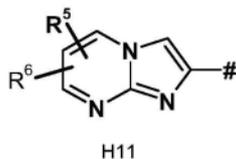
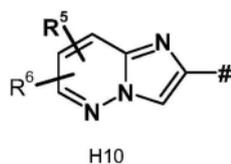
氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷基-(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(C₁-C₄) 烷硫基、(C₁-C₄) 卤代烷硫基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₄) 烷基羰基、(C₁-C₄) 卤代烷基羰基、氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₄) 烷基氨基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、NHC(O)-(C₁-C₄) 烷基((C₁-C₄) 烷基羰基氨基)，

[0086] R⁴特别优选表示氢、卤素、氰基或(C₁-C₄)-烷基，

[0087] X特别优选表示选自H1至H19的杂芳族9元或12元稠合的双环或三环环体系，



[0088]



[0089] R^5 、 R^6 特别优选彼此独立地表示氢、氰基、卤素、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 卤代烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_2-C_4) 卤代炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) 烷氧基亚氨基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 卤代烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氧基、 (C_1-C_4) 烷基羰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基羰基、氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基氨基、 (C_1-C_4) 烷基氨基、二- (C_1-C_4) 烷基氨基、氨基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基或二- (C_1-C_4) 烷基氨基磺酰基，

[0090] R^7 特别优选表示 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 氰基烷基、 (C_1-C_4) 羟基烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 烯氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 卤代烯氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 卤代烯基、 (C_2-C_4) 氰基烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_2-C_4) 炔氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 卤代炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基- (C_3-C_6) 环烷基、卤代 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基- (C_1-C_4) 烷基或 (C_1-C_4) 烷基羰基- (C_1-C_4) 烷基，

[0091] R^8 特别优选表示氢、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_3-C_6) 环烷基或 (C_3-C_6) 环烷基- (C_1-C_4) 烷基，表示在每种情况下任选地被卤素、氰基、苯基或吡啶基单取代的 (C_1-C_4) 烷基或 (C_1-C_4) 烷氧基，其中苯基或吡啶基在每种情况下可被以下相同或不同的取代基单取代或双取代：三氟甲基、氰基、氟、氯、溴或三氟甲氧基，或

[0092] R^8 特别优选表示苯基、吡啶基或包含1-2个选自N、S和O的杂原子的3元至6元饱和杂环，其中苯基、吡啶基和杂环各自可任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代，且其中所述取代基可彼此独立地选自 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、卤素或氰基，

[0093] R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 特别优选彼此独立地表示任选地被卤素、氰基、苯基或吡啶基单取代的 (C_1-C_4) 烷基，其中苯基或吡啶基在每种情况下可任选地被选自以下的相同或不同的取代基单取代或双取代：三氟甲基、氰基、氟、氯或三氟甲氧基，或

[0094] R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} ，特别优选彼此独立地表示苯基、吡啶基或包含1-2个选自N、S和O的杂原子的3元至6元饱和杂环，其中苯基、吡啶基和杂环各自可被相同或不同的取代基单取代或双取代，且其中所述取代基可彼此独立地选自 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、卤素和氰基，

[0095] R^{11} 、 R^{12} 特别优选彼此独立地表示氢或表示 R^{13} ，

[0096] n特别优选表示0、1或2，

[0097] p特别优选表示0或1。

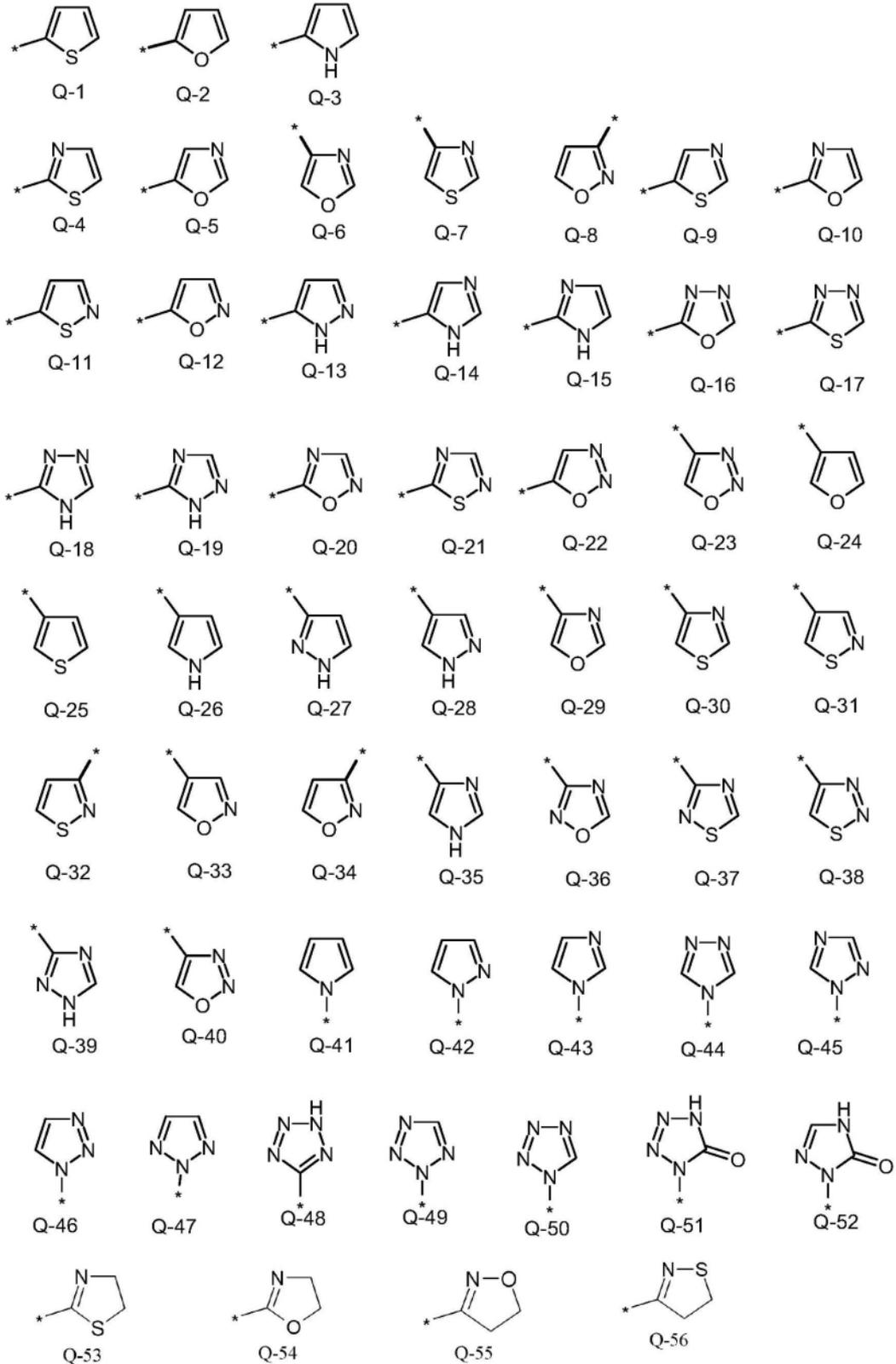
[0098] 构型3-2：

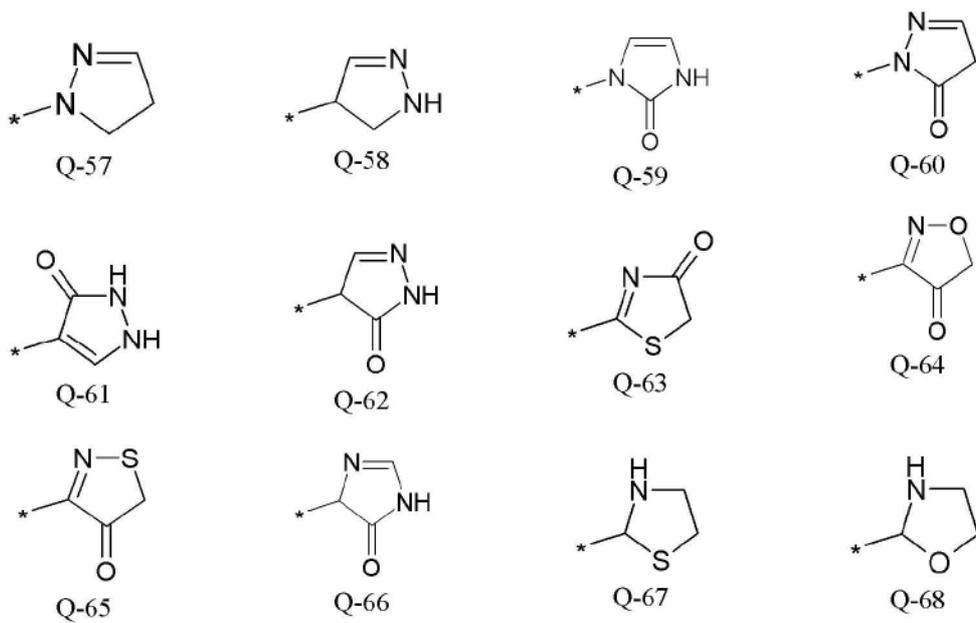
[0099] A^1 、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、n和p具有构型3-1中给出的含义且

[0100] R^2 特别优选表示选自任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代的Q1至Q101的5元或6元饱和的、部分饱和的或杂芳族环，其在每种情况下可含有至少一个羰基基团和/或其中可能的取代基在每种情况下为：氢、氰基、 (C_1-C_4) 氰基烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、卤素、氨基、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 卤代烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_2-C_4) 卤代炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷基- (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) 烷氧基亚氨基、-C(H)=N-O (C_1-C_4) 烷

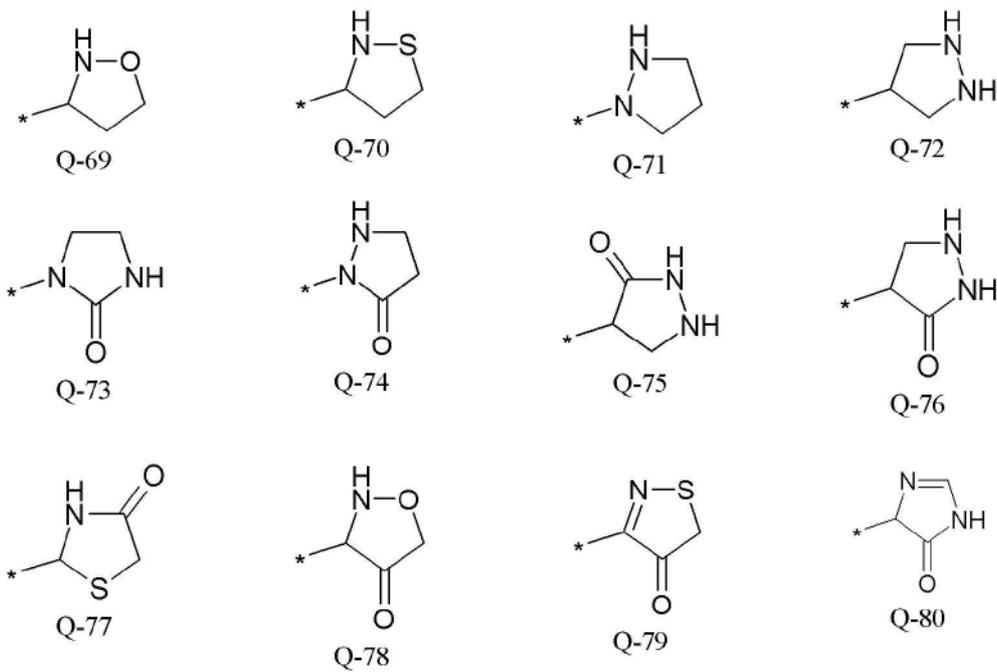
基、(C₁-C₄) 烷硫基、(C₁-C₄) 卤代烷硫基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氧基、(C₁-C₄) 烷基羰基、(C₁-C₄) 卤代烷基羰基、氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₄) 烷基氨基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基、氨基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基羰基氨基，

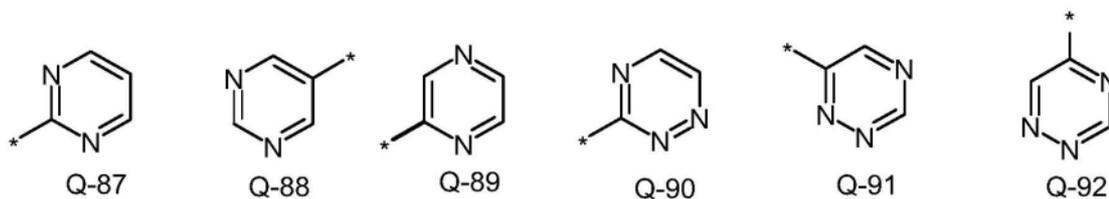
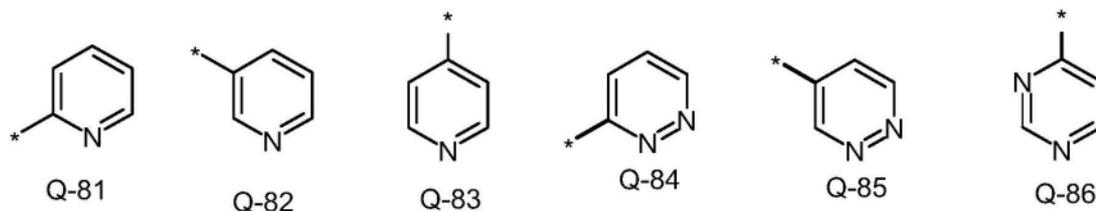
[0101]



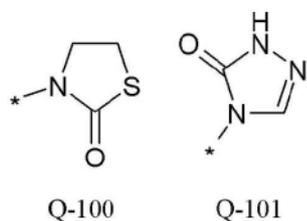
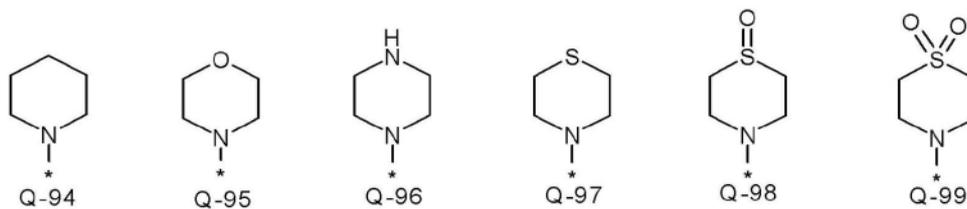
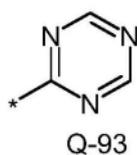


[0102]





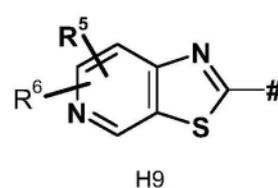
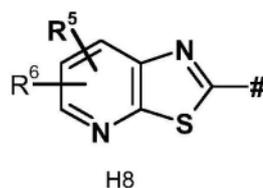
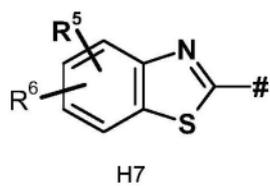
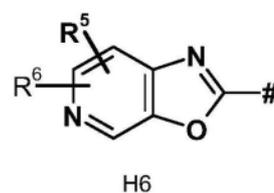
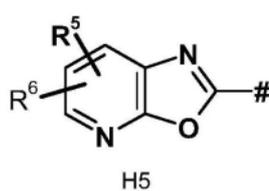
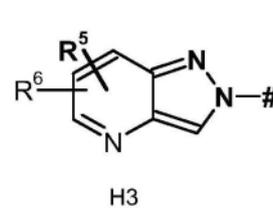
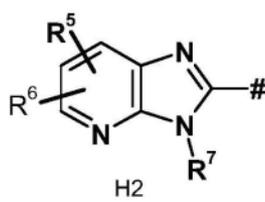
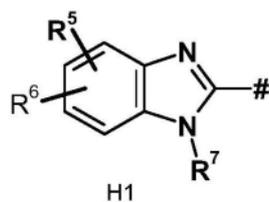
[0103]



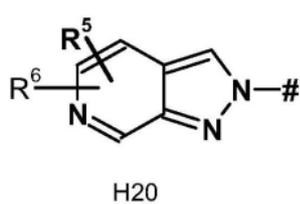
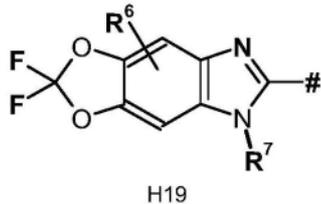
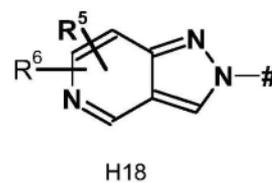
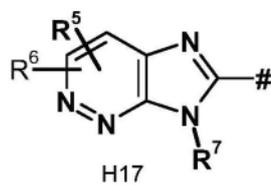
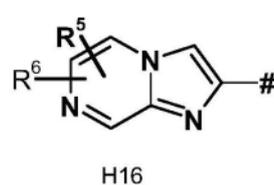
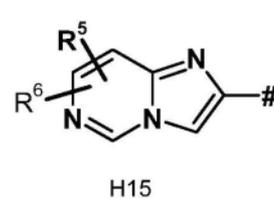
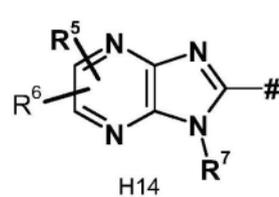
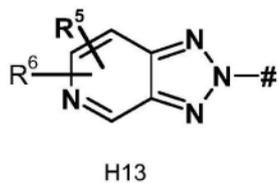
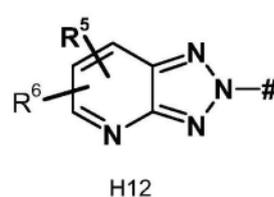
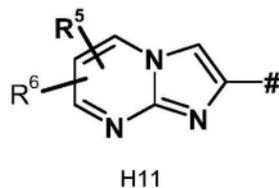
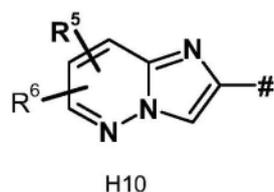
[0104] 其中连接至分子剩余部分的键由星号*表示,

[0105] R^2 还特别优选表示选自以下的基团:G1、G2、G3、G4、G6、G7、G8、G9、G10、G11、G12、G13、G14、G15、G16、G18或G19,[0106] 其中如果 R^2 表示G6、G7、G8、G9,则n表示2,

[0107] X特别优选表示选自H1至H20的杂芳族9元或12元稠合的双环或三环环体系,



[0108]



[0109] 其中连接至分子剩余部分的键由井号#表示，

[0110] R⁸特别优选表示氢、氨基、(C₁-C₄) 烷硫基- (C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基- (C₁-

C_4 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基氨基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_3-C_6) 环烷基或 (C_3-C_6) 环烷基- (C_1-C_4) 烷基, 表示在每种情况下任选地被卤素、氰基、苯基或吡啶基单取代的 C_1-C_4 烷基或 (C_1-C_4) 烷氧基, 其中苯基或吡啶基在每种情况下可任选地被选自以下的相同或不同的取代基单取代或双取代: 三氟甲基、氰基、氟、氯、溴或三氟甲氧基, 或

[0111] R^8 特别优选表示苯基、噻唑基、吡唑基、吡啶基或包含 1-2 个选自 N、S 和 O 的杂原子的 3 元至 6 元饱和杂环, 其中苯基、吡啶基和杂环各自可任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代, 且其中所述取代基可彼此独立地选自 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、卤素或氰基,

[0112] R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 特别优选彼此独立地表示任选地被卤素、氰基、苯基或吡啶基单取代的 (C_1-C_4) 烷基或 (C_3-C_6) 环烷基, 其中苯基或吡啶基在每种情况下可任选地被选自以下的相同或不同的取代基单取代或双取代: 三氟甲基、氰基、氟、氯或三氟甲氧基, 或

[0113] R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} , 特别优选彼此独立地表示苯基、吡啶基或包含 1-2 个选自 N、S 和 O 的杂原子的 3 元至 6 元饱和杂环, 其中苯基、吡啶基和杂环各自可被相同或不同的取代基单取代或双取代, 且其中所述取代基可彼此独立地选自 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、卤素和氰基,

[0114] R^{11} 、 R^{12} 特别优选彼此独立地表示氢或表示 R^{13} ,

[0115] 其中如果 R^2 表示任选取代的 Q45, 则 X 不为 H1、H2 或 H4, 如果 R^2 表示 G10、G11、G12、G13、G14、G15 或 G16 且 A^1 表示 N, 则 X 不表示 H1、H2、H4、H5、H7、H8 或 H14。

[0116] 环 Q1 至 Q101 处的取代可以通过在 C 原子和/或 N 原子处氢的取代来进行。

[0117] 构型 4-1:

[0118] A^1 非常特别优选表示氮或 $=C-R^4$,

[0119] R^1 非常特别优选表示甲基、乙基、正丙基、异丙基、环丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、环丁基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟乙基、二氟乙基、三氟乙基、四氟乙基或五氟乙基,

[0120] R^2 非常特别优选表示任选地被以下基团单取代的环: 氰基、 (C_1-C_4) 氰基烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、卤素、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 卤代烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基氨基羰基、 (C_1-C_4) 烷基羰基氨基, 所述环选自 Q-25、Q-41、Q-42、Q-43、Q-44、Q-45、Q-46、Q-47、Q-52 或 Q-95,

[0121] R^2 还非常特别优选表示选自 G1、G2、G3、G4、G6、G7、G8、G9、G10、G11、G12、G13、G14、G15、G16 或 G18 的基团,

[0122] 其中如果 R^2 表示 G6、G7、G8、G9, 则 n 表示 2,

[0123] R^3 非常特别优选表示氢、氰基、卤素、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷硫基、 (C_1-C_4) 卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) 卤代烷基磺酰基或 $NHCO-(C_1-C_4)$ 烷基 ((C_1-C_4) 烷基羰基氨基),

[0124] R^4 非常特别优选表示氢、氟、氯、溴或氰基,

[0125] X 非常特别优选表示选自系列 H1、H2、H3、H4、H5、H6、H7、H8、H9、H10、H11、H12、H13、H14、H15、H16、H17、H18 或 H19 的杂芳族 9 元或 12 元稠合的双环或三环体系,

[0126] R^5 非常特别优选表示氢、氰基、卤素、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_2-C_4) 烯基、

(C₂-C₄) 卤代烯基、(C₂-C₄) 炔基、(C₂-C₄) 卤代炔基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₃-C₆) 环烷基-(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷基-(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 卤代烷氧基、(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-C₄) 烷基羰基、(C₁-C₄) 卤代烷基羰基、(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基或二-(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基，

[0127] R⁶非常特别优选表示氢，

[0128] R⁷非常特别优选表示(C₁-C₄)-烷基或(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基，

[0129] R⁸非常特别优选表示氢、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₃-C₆) 环烷基-(C₁-C₄) 烷基或(C₁-C₄) 烷氧基，或

[0130] R⁸非常特别优选表示苯基或吡啶基，其中苯基或吡啶基在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代，且其中所述取代基可彼此独立地选自C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、卤素和氰基，

[0131] R¹³、R¹⁴、R¹⁵非常特别优选彼此独立地表示(C₁-C₄) 烷基或

[0132] R¹³、R¹⁴、R¹⁵非常特别优选彼此独立地表示苯基或吡啶基，其中苯基或吡啶基在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代，且其中取代基可彼此独立地选自C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、卤素和氰基，

[0133] R¹¹、R¹²非常特别优选彼此独立地表示氢或表示R¹³，

[0134] n非常特别优选表示0、1或2，

[0135] p非常特别优选表示0或1。

[0136] 构型4-2：

[0137] A¹非常特别优选表示氮或=C-R⁴，

[0138] R¹非常特别优选表示甲基、乙基、正丙基、异丙基、环丙基、正丁基、异丁基、叔丁基、环丁基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟乙基、二氟乙基、三氟乙基、四氟乙基或五氟乙基，

[0139] R²非常特别优选表示任选地被以下基团单取代的环：氰基、(C₁-C₄) 氰基烷基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、卤素、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷硫基、(C₁-C₄) 卤代烷硫基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基、(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基羰基氨基，所述环选自Q-25、Q-41、Q-42、Q-43、Q-44、Q-45、Q-46、Q-47、Q-52或Q-95，

[0140] R²还非常特别优选表示选自G1、G2、G3、G4、G10、G11、G12、G13、G14、G15、G18或G19的基团，

[0141] R³非常特别优选表示氢、氰基、卤素、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 卤代烷氧基、(C₁-C₄) 烷硫基、(C₁-C₄) 烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷硫基、(C₁-C₄) 卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄) 卤代烷基磺酰基或NHC(O)-(C₁-C₄) 烷基((C₁-C₄) 烷基羰基氨基)，R⁴非常特别优选表示氢、氟、氯、溴或氰基，

[0142] X非常特别优选表示选自系列H1、H2、H3、H4、H5、H7、H8、H10、H11、H12、H13、H15、H16、H17、H18、H19或H20的杂芳族9元或12元稠合的双环或三环环体系，

[0143] R⁵非常特别优选表示氢、氰基、卤素、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₂-C₄) 烯基、(C₂-C₄) 卤代烯基、(C₂-C₄) 炔基、(C₂-C₄) 卤代炔基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₃-C₆) 环烷基-(C₃-C₆) 环

烷基、(C₁-C₄) 烷基-(C₃-C₆) 环烷基、(C₁-C₄) 烷氧基、(C₁-C₄) 卤代烷氧基、(C₁-C₄) 烷氧基亚氨基、(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-C₄) 烷基羰基、(C₁-C₄) 卤代烷基羰基、(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、二-(C₁-C₄) 烷基氨基羰基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基氨基、(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基或二-(C₁-C₄) 烷基氨基磺酰基，

[0144] R⁶非常特别优选表示氢，

[0145] R⁷非常特别优选表示(C₁-C₄)-烷基或(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基，

[0146] R⁸非常特别优选表示氢、(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 卤代烷基、(C₁-C₄) 烷氧基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷硫基-(C₁-C₄) 烷基、(C₁-C₄) 烷基磺酰基-(C₁-C₄) 烷基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₃-C₆) 环烷基-(C₁-C₄) 烷基或(C₁-C₄) 烷氧基，或

[0147] R⁸非常特别优选表示苯基或吡啶基，其中苯基或吡啶基在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代，且其中所述取代基可彼此独立地选自C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、卤素和氰基，

[0148] R¹³、R¹⁴、R¹⁵非常特别优选彼此独立地表示(C₁-C₄) 烷基或(C₃-C₆) 环烷基或

[0149] R¹³、R¹⁴、R¹⁵非常特别优选彼此独立地表示苯基或吡啶基，其中苯基或吡啶基在每种情况下可任选地被相同或不同的取代基单取代或双取代，且其中所述取代基可彼此独立地选自C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基、卤素和氰基，或表示氧杂环丁烷基，

[0150] R¹¹、R¹²非常特别优选彼此独立地表示氢或表示R¹³，

[0151] n非常特别优选表示0、1或2，

[0152] p非常特别优选表示0或1，

[0153] 其中如果R²表示任选取代的Q45，则X不为H1、H2或H4，如果R²表示G10、G11、G12、G13、G14或G15且A¹表示N，则X不表示H1、H2、H4、H5、H7或H8。

[0154] 构型5-1：

[0155] A¹最优选表示氮或=C-R⁴，

[0156] R¹最优选表示甲基、乙基、正丙基、异丙基或环丙基，

[0157] R²最优选表示选自系列Q-25、Q-41、Q-42、Q-43、Q-44、Q-45、Q-46、Q-47、Q-52或Q-95(特别最优选表示Q-42、Q-43、Q-44、Q-45、Q46、Q-47或Q-52)的环，所述环任选地被以下基团单取代：氟、氯、溴、碘、氰基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲基、三氟甲硫基、二氟甲基、五氟乙基、环丙基、甲基氨基羰基、甲基羰基氨基、甲基磺酰基或甲硫基，

[0158] R²还最优选表示选自G1、G10、G12、G13或G14(特别最优选表示G12或G13)的基团，

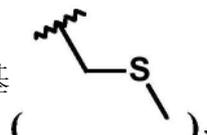
[0159] R³最优选表示氢、氰基、甲基、乙基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟乙基、二氟乙基、三氟乙基、四氟乙基、五氟乙基、三氟甲氧基、二氟氯甲氧基、二氯氟甲氧基、三氟甲硫基、三氟甲基磺酰基、三氟甲基亚磺酰基、氟、溴或氯(特别最优选氢)，

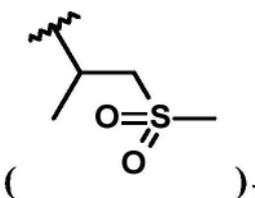
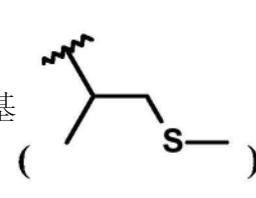
[0160] R⁴最优选表示氢，

[0161] X最优选表示选自系列H1、H2、H3、H4、H5、H7、H8、H10、H11、H15、H16、H17或H19的杂芳族9元或12元稠合的双环或三环体系，

[0162] R⁵最优选表示氟、氯、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟乙基、二氟乙基、三氟乙基、四氟乙基、五氟乙基、三氟甲氧基、二氟氯甲氧基、二氯氟甲氧基、三氟甲硫基、三氟甲基磺酰基或三氟甲基亚磺酰基(特别最优选表示三氟甲基)，

- [0163] R^6 最优选表示氢，
 [0164] R^7 最优选表示甲基、乙基、异丙基、甲氧基甲基或甲氧基乙基 (特别最优选表示甲基)，
 [0165] R^8 最优选表示氢、甲基、乙基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、二氟甲基、四氟乙基、五氟乙基、甲氧基甲基、环丙基、环丙基甲基、甲氧基或乙氧基，或表示苯基，
 [0166] R^{13} 最优选表示甲基、乙基、异丙基、叔丁基、苄基或甲基磺酰基，
 [0167] R^{11} 、 R^{12} 最优选彼此独立地表示氢或表示 R^{13} ，
 [0168] n 最优选表示0、1或2。
 [0169] 构型5-2：
 [0170] A^1 最优选表示氮，
 [0171] R^1 最优选表示甲基、乙基、正丙基、异丙基或环丙基，
 [0172] R^2 最优选表示选自系列Q-42、Q-43、Q-45或Q-47的环，所述环任选地被以下基团单取代：氟、氯、溴、碘、三氟甲基、二氟甲基或五氟乙基，
 [0173] R^2 还最优选表示选自G10的基团，其中 R^{11} 表示氢且 R^{12} 表示氢或氧杂环丁烷基
 [0174] 或G12，其中 R^{11} 表示氢且 R^8 表示氢、甲基、乙基、异丙基、叔丁基、三氟甲基、二氟甲

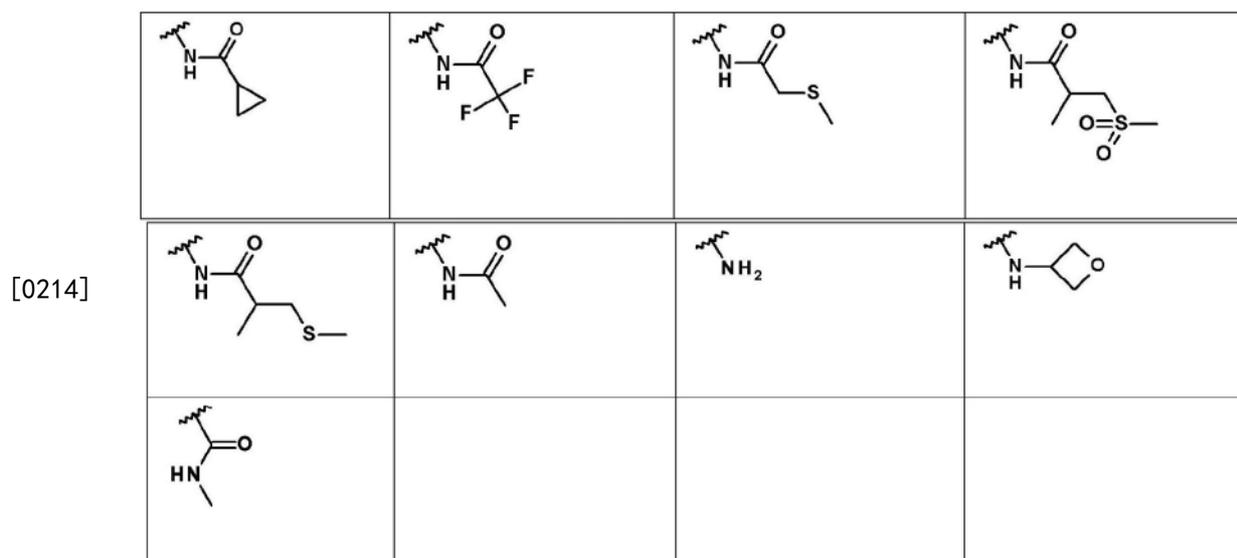
基、四氟乙基、五氟乙基、环丙基、环丙基甲基、甲基硫烷基甲基  甲基磺酰基
 ()、

丙-2-基  1-(甲基硫烷基)丙-2-基 
 ()、

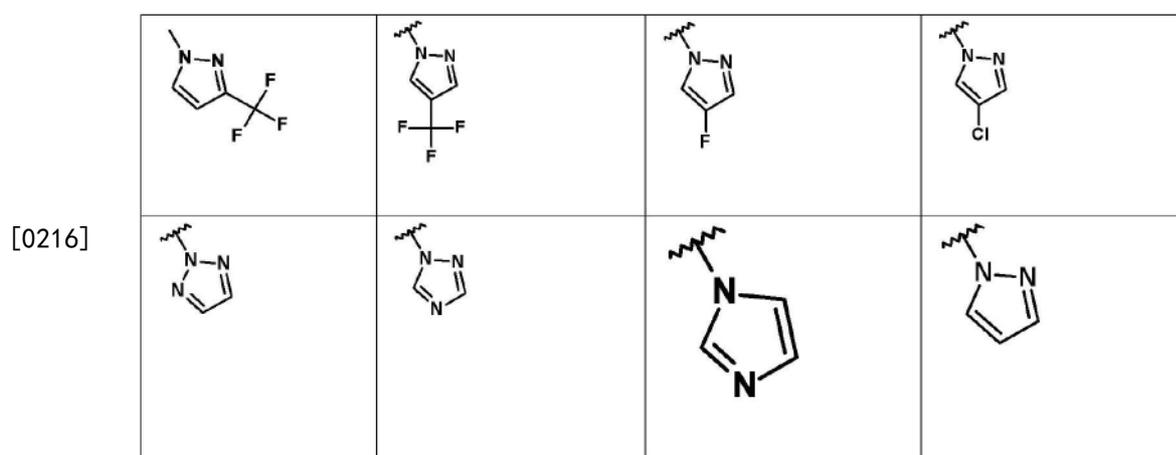
- [0175] 或G3，其中 R^{11} 表示氢且 R^{12} 表示甲基、乙基、异丙基、环丙基或叔丁基，
 [0176] R^3 最优选表示氢，
 [0177] X 最优选表示选自系列H1、H2、H5、H15、H16、H17或H19的杂芳族9元或12元稠合的双环或三环体系，
 [0178] R^5 最优选表示氟、氯、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟乙基、二氟乙基、三氟乙基、四氟乙基、五氟乙基、三氟甲氧基、二氟氯甲氧基、二氯氟甲氧基、三氟甲硫基、三氟甲基磺酰基或三氟甲基亚磺酰基，
 [0179] R^6 最优选表示氢，
 [0180] R^7 最优选表示甲基、乙基、异丙基、甲氧基甲基或甲氧基乙基，
 [0181] n 最优选表示0、1或2，
 [0182] 其中如果 R^2 表示任选取代的Q45，则 X 不为H1或H2，如果 R^2 表示G10或G12，则 X 不表示H1、H2或H5。

- [0183] 构型6-1：
 [0184] A^1 特别表示氮，
 [0185] R^1 特别表示乙基、
 [0186] R^2 特别表示选自系列Q-42的任选地被氯或三氟甲基取代的环，

- [0187] R^2 还特别表示选自G10或G12的基团，
- [0188] R^3 特别表示氢，
- [0189] X特别表示选自系列H1、H2或H19的杂芳族9元或12元稠合的双环或三环环体系，
- [0190] R^5 特别表示三氟甲基，
- [0191] R^6 特别表示氢，
- [0192] R^7 特别表示甲基，
- [0193] R^8 特别表示甲基、三氟甲基或环丙基，
- [0194] R^{11} 、 R^{12} 彼此独立地特别表示氢，
- [0195] n特别表示1或2。
- [0196] 构型6-2a:
- [0197] A^1 特别表示氮，
- [0198] R^1 特别表示乙基，
- [0199] R^2 特别表示选自系列Q-42、Q-43、Q-45或Q-47的任选地被氟、氯或三氟甲基单取代的环，
- [0200] R^2 还特别表示选自G10的基团，其中 R^{11} 表示氢且 R^{12} 表示氢  或
- [0201] 或G12，其中 R^{11} 表示氢且 R^8 表示甲基、三氟甲基、环丙基、
- [0202] $-\text{CH}_2\text{SCH}_3$ 、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SCH}_3$ 或 $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_3$
- [0203] 或G3，其中 R^{11} 表示氢且 R^{12} 表示甲基，
- [0204] R^3 特别表示氢，
- [0205] X特别表示选自系列H1、H2、H5、H15、H16、H17或H19的杂芳族9元或12元稠合的双环或三环环体系，
- [0206] R^5 特别表示三氟甲基，
- [0207] R^6 特别表示氢，
- [0208] R^7 特别表示甲基，
- [0209] n特别表示0、1或2，
- [0210] 其中如果 R^2 表示任选取代的Q45，则X不表示H1或H2，如果 R^2 表示G10或G12，则X不表示H1、H2或H5。
- [0211] 构型6-2b:
- [0212] A^1 、 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、X和n具有构型6-2a中给出的含义且
- [0213] R^2 特别表示选自以下系列的基团



[0215] R^2 还特别表示选自以下系列的基团

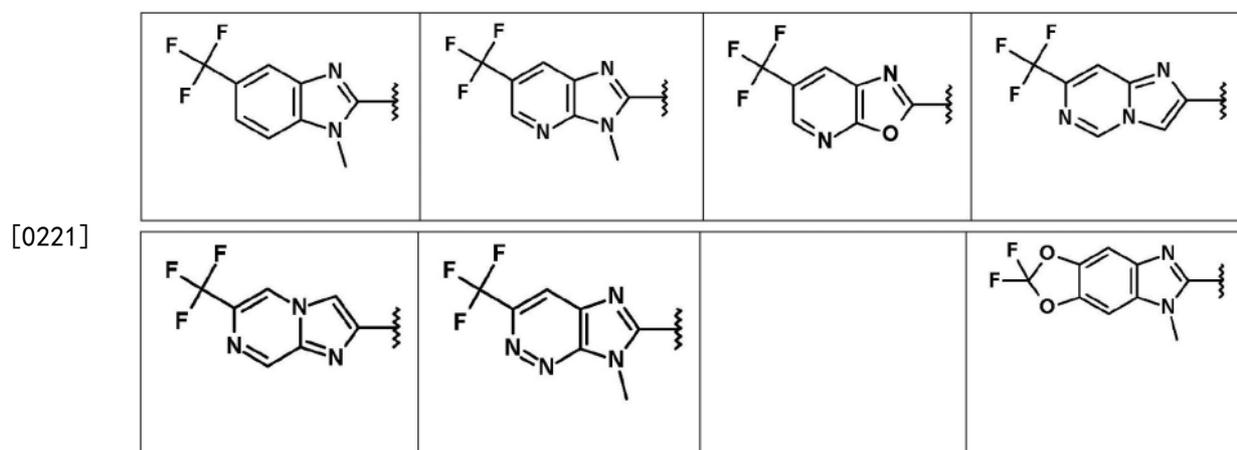


[0217] 其中如果 R^2 表示任选取代的Q45,则X不表示H1或H2,如果 R^2 表示G10或G12,则X不表示H1、H2或H5。

[0218] 构型6-2c:

[0219] A^1 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 和n具有构型6-2a中给出的含义且

[0220] X特别表示选自以下系列的基团



[0222] 其中如果 R^2 表示任选取代的Q45,则X不表示H1或H2,如果 R^2 表示G10或G12,则X不表

示H1、H2或H5。

[0223] A^1 表示 $=N^+-O^-$ 意指 $=N^+(O^-)-$ ； A^1 表示 $=C-R^4$ 意指 $=C(R^4)-$ （与 CR^4 相同）。

[0224] 最优选的是式(I)的化合物，其中 A^1 、 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、X和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义且 R^2 表示选自系列Q-42或Q-47的任选地被氟、氯或三氟甲基单取代的环。

[0225] 最优选的还是式(I)的化合物，其中 A^1 、 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、X和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义且 R^2 表示选自系列Q-42或Q-47的任选地被氟、氯、溴、碘、三氟甲基、二氟甲基或五氟乙基单取代的环。

[0226] 最优选的是式(I)的化合物，其中 A^1 、 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、X和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义且 R^2 表示选自系列Q-45的任选地被氟、氯或三氟甲基单取代的环，其中X不能表示H1、H2或H4。

[0227] 最优选的是式(I)的化合物，其中 A^1 、 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、X和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义且 R^2 表示G3。

[0228] 最优选的是式(I)的化合物，其中 A^1 、 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 R^{12} 、X和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义且 R^2 表示G10或G12，其中X不能表示H1、H2、H4、H5、H7、H8或H14。

[0229] 在一个优选的实施方案中，本发明涉及式(I)的化合物，其中X表示H1且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0230] 在一个优选的实施方案中，本发明涉及式(I)的化合物，其中X表示H1且 R^2 表示G10且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0231] 在一个优选的实施方案中，本发明涉及式(I)的化合物，其中X表示H1且 R^2 表示G12且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0232] 在一个优选的实施方案中，本发明涉及式(I)的化合物，其中X表示H1且 R^2 表示G13且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0233] 在一个优选的实施方案中，本发明涉及式(I)的化合物，其中X表示H1， R^2 表示Q42（任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代）且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0234] 在一个优选的实施方案中，本发明涉及式(I)的化合物，其中X表示H1， R^2 表示Q43

(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0235] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H1, R^2 表示Q44(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0236] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H1, R^2 表示Q45(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0237] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H1, R^2 表示Q46(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0238] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H1, R^2 表示Q47(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0239] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H1, R^2 表示Q52(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0240] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H2且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0241] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H2且 R^2 表示G10且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0242] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H2且 R^2 表示G12且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0243] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H2且 R^2 表示G13

且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0244] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中 X 表示 H_2 , R^2 表示Q42(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0245] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中 X 表示 H_2 , R^2 表示Q43(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0246] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中 X 表示 H_2 , R^2 表示Q44(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0247] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中 X 表示 H_2 , R^2 表示Q45(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0248] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中 X 表示 H_2 , R^2 表示Q46(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0249] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中 X 表示 H_2 , R^2 表示Q47(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0250] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中 X 表示 H_2 , R^2 表示Q52(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0251] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中 X 表示 H_3 且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^1 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型

(5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0252] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H3 且 R² 表示 G10 且 R¹、R³、R⁵、R⁶、R⁷、R¹¹、R¹²、A¹ 和 n 具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0253] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H3 且 R² 表示 G12 且 R¹、R³、R⁵、R⁶、R⁸、R¹¹、A¹ 和 n 具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0254] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H3 且 R² 表示 G13 且 R¹、R³、R⁵、R⁶、R⁸、R¹¹、A¹ 和 n 具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0255] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H3, R² 表示 Q42 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹ 和 n 具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0256] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H3, R² 表示 Q43 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹ 和 n 具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0257] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H3, R² 表示 Q44 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹ 和 n 具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0258] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H3, R² 表示 Q45 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹ 和 n 具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0259] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H3, R² 表示 Q46 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹ 和 n 具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0260] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H3, R² 表示 Q47 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹ 和 n 具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或

构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0261] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H3, R^2 表示Q52 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0262] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H4且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0263] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H4且 R^2 表示G10 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0264] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H4且 R^2 表示G12 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0265] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H4且 R^2 表示G13 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0266] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H4, R^2 表示Q42 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0267] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H4, R^2 表示Q43 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0268] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H4, R^2 表示Q44 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0269] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H4, R^2 表示Q45 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0270] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H4, R^2 表示Q46

(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0271] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H4, R^2 表示Q47(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0272] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H4, R^2 表示Q52(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0273] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H5且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0274] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H5且 R^2 表示G10且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0275] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H5且 R^2 表示G12且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0276] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H5且 R^2 表示G13且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0277] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H5, R^2 表示Q42(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0278] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H5, R^2 表示Q43(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0279] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H5, R^2 表示Q44(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、

R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0280] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H5, R^2 表示Q45(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0281] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H5, R^2 表示Q46(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0282] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H5, R^2 表示Q47(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0283] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H5, R^2 表示Q52(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0284] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H6且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0285] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H6且 R^2 表示G10且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0286] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H6且 R^2 表示G12且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0287] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H6且 R^2 表示G13且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0288] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H6, R^2 表示Q42(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0289] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H6, R^2 表示Q43(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0290] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H6, R^2 表示Q44(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0291] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H6, R^2 表示Q45(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0292] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H6, R^2 表示Q46(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0293] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H6, R^2 表示Q47(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0294] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H6, R^2 表示Q52(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0295] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H7且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0296] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H7, R^2 表示G10且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0297] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H7且 R^2 表示G12且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0298] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H7且R²表示G13且R¹、R³、R⁵、R⁶、R⁸、R¹¹、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0299] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H7,R²表示Q42(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0300] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H7,R²表示Q43(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0301] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H7,R²表示Q44(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0302] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H7,R²表示Q45(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0303] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H7,R²表示Q46(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0304] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H7,R²表示Q47(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0305] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H7,R²表示Q52(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0306] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H8且R¹、R²、R³、

R^5 、 R^6 、 R^1 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0307] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H8, R^2 表示G10且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0308] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H8, R^2 表示G12且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0309] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H8, R^2 表示G13且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0310] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H8, R^2 表示Q42(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0311] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H8, R^2 表示Q43(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0312] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H8, R^2 表示Q44(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0313] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H8, R^2 表示Q45(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0314] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H8, R^2 表示Q46(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0315] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H8, R^2 表示Q47(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、

R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0316] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H8, R^2 表示Q52(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0317] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H9且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^1 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0318] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H9, R^2 表示G10且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0319] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H9, R^2 表示G12且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0320] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H9, R^2 表示G13且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0321] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H9, R^2 表示Q42(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0322] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H9, R^2 表示Q43(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0323] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H9, R^2 表示Q44(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0324] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H9, R^2 表示Q45(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0325] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H9, R^2 表示Q46(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0326] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H9, R^2 表示Q47(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0327] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H9, R^2 表示Q52(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0328] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H10且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0329] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H10, R^2 表示G10且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0330] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H10, R^2 表示G12且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0331] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H10, R^2 表示G13且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0332] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H10, R^2 表示Q42(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0333] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H10, R^2 表示Q43(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0334] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H10, R^2 表示Q44(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲

基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0335] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H10, R^2 表示Q45(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0336] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H10, R^2 表示Q46(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0337] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H10, R^2 表示Q47(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0338] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H10, R^2 表示Q52(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0339] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H11且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0340] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H11, R^2 表示G10且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0341] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H11, R^2 表示G12且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0342] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H11, R^2 表示G13且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0343] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H11, R^2 表示Q42(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或

构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0344] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H11, R^2 表示Q43 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0345] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H11, R^2 表示Q44 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0346] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H11, R^2 表示Q45 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0347] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H11, R^2 表示Q46 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0348] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H11, R^2 表示Q47 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0349] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H11, R^2 表示Q52 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0350] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H12且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0351] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H12, R^2 表示G10 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0352] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H12, R^2 表示G12 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型

(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0353] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H12,R²表示G13且R¹、R³、R⁵、R⁶、R⁸、R¹¹、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0354] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H12,R²表示Q42(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0355] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H12,R²表示Q43(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0356] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H12,R²表示Q44(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0357] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H12,R²表示Q45(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0358] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H12,R²表示Q46(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0359] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H12,R²表示Q47(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0360] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H12,R²表示Q52(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0361] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H13且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^1 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0362] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H13, R^2 表示G10且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0363] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H13, R^2 表示G12且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0364] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H13, R^2 表示G13且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0365] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H13, R^2 表示Q42(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0366] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H13, R^2 表示Q43(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0367] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H13, R^2 表示Q44(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0368] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H13, R^2 表示Q45(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0369] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H13, R^2 表示Q46(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0370] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H13, R^2 表示Q47(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲

基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0371] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H13, R^2 表示Q52(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0372] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H14且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0373] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H14, R^2 表示G10且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0374] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H14, R^2 表示G12且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0375] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H14, R^2 表示G13且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0376] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H14, R^2 表示Q42(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0377] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H14, R^2 表示Q43(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0378] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H14, R^2 表示Q44(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0379] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H14, R^2 表示Q45(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0380] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H14, R^2 表示Q46 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0381] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H14, R^2 表示Q47 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0382] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H14, R^2 表示Q52 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0383] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H15且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^1 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0384] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H15, R^2 表示G10 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0385] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H15, R^2 表示G12 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0386] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H15, R^2 表示G13 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0387] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H15, R^2 表示Q42 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0388] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H15, R^2 表示Q43 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和n具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0389] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式 (I) 的化合物,其中X表示H15, R^2 表示Q44

(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0390] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H15, R^2 表示Q45(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0391] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H15, R^2 表示Q46(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0392] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H15, R^2 表示Q47(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0393] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H15, R^2 表示Q52(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0394] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H16且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^1 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0395] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H16, R^2 表示G10且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0396] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H16, R^2 表示G12且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0397] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H16, R^2 表示G13且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0398] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H16, R^2 表示Q42(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、

R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0399] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H16, R^2 表示Q43(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0400] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H16, R^2 表示Q44(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0401] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H16, R^2 表示Q45(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0402] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H16, R^2 表示Q46(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0403] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H16, R^2 表示Q47(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0404] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H16, R^2 表示Q52(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0405] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H17且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0406] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H17, R^2 表示G10且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0407] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H17, R^2 表示G12

且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0408] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H17, R^2 表示G13且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0409] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H17, R^2 表示Q42(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0410] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H17, R^2 表示Q43(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0411] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H17, R^2 表示Q44(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0412] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H17, R^2 表示Q45(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0413] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H17, R^2 表示Q46(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0414] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H17, R^2 表示Q47(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0415] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H17, R^2 表示Q52(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0416] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H18 且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^1 、 A^1 和 n 具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0417] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H18, R^2 表示 G10 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0418] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H18, R^2 表示 G12 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0419] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H18, R^2 表示 G13 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0420] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H18, R^2 表示 Q42 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0421] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H18, R^2 表示 Q43 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0422] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H18, R^2 表示 Q44 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0423] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H18, R^2 表示 Q45 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0424] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H18, R^2 表示 Q46 (任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代) 且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型 (3-1) 或构型 (3-2) 或构型 (4-1) 或构型 (4-2) 或构型 (5-1) 或构型 (5-2) 或构型 (6-1) 或构型 (6-2a) 或构型 (6-2b) 中给出的含义。

[0425] 在一个优选的实施方案中, 本发明涉及式 (I) 的化合物, 其中 X 表示 H18, R^2 表示 Q47

(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0426] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H18, R^2 表示Q52(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0427] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H19且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^7 、 R^6 、 R^1 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0428] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H19, R^2 表示G10且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0429] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H19, R^2 表示G12且 R^1 、 R^3 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0430] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H19, R^2 表示G13且 R^1 、 R^3 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0431] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H19, R^2 表示Q42(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0432] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H19, R^2 表示Q43(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0433] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H19, R^2 表示Q44(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0434] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H19, R^2 表示Q45(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^6 、

R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0435] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H19, R^2 表示Q46(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0436] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H19, R^2 表示Q47(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0437] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H19, R^2 表示Q52(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0438] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H20且 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0439] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H20, R^2 表示G10且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0440] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H20, R^2 表示G12且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0441] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H20, R^2 表示G13且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0442] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H20, R^2 表示Q42(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0443] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H20, R^2 表示Q43(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0444] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H20,R²表示Q44(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、R⁷、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0445] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H20,R²表示Q45(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、R⁷、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0446] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H20,R²表示Q46(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、R⁷、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0447] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H20,R²表示Q47(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、R⁷、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0448] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H20,R²表示Q52(任选地被卤素、氰基、三氟甲基、二氟甲基、五氟乙基、甲基磺酰基、甲硫基、氰基甲基、甲基、甲氧基甲基、三氟甲硫基、环丙基、甲基氨基羰基或甲基羰基氨基单取代)且R¹、R³、R⁵、R⁶、R⁷、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0449] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H1且R²具有表1中给出的含义且R¹、R³、R⁵、R⁶、R⁷、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0450] 表1:

[0451]

R^2
乙酰基氨基
丙酰基氨基
环丙烷羰基氨基
(2-环丙基乙酰基)氨基
2-甲基丙酰基氨基
(2-甲氧基乙酰基)氨基
苯甲酰氨基
(2,2-二氟乙酰基)氨基
(2,2,2-三氟乙酰基)氨基
2,2,3,3,3-五氟丙酰基氨基
2,2,3,3-四氟丙酰基氨基
甲氧基羰基
氨基
吗啉-4-基
3-[(三氟甲基)硫烷基]-1H-吡咯-1-基
4-(甲基磺酰基)-1H-吡唑-1-基
3-(甲基氨基甲酰基)-1H-吡唑-1-基
4-(甲基氨基甲酰基)-1H-吡唑-1-基

[0452]

3-(甲基磺酰基)-1H-1,2,4-三唑-1-基
4-氯-1H-吡唑-1-基
3-氯-1H-吡唑-1-基
4-碘-1H-吡唑-1-基
3-碘-1H-吡唑-1-基
3-氟-1H-吡唑-1-基
4-溴-1H-吡唑-1-基
3-溴-1H-吡唑-1-基
3-(氟基甲基)-1H-吡唑-1-基
3-(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基
3-(甲氧基甲基)-1H-吡唑-1-基
3-乙酰胺基-1H-1,2,4-三唑-1-基
4-环丙基-1H-吡唑-1-基
4-碘-1H-咪唑-1-基
3-(甲基硫烷基)-1H-1,2,4-三唑-1-基
4-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基
2H-1,2,3-三唑-2-基
1H-1,2,4-三唑-1-基
3-氯-1H-1,2,4-三唑-1-基
4-氟基-1H-吡唑-1-基
3-噻吩基
1H-吡唑-1-基
3-氟基-1H-吡唑-1-基
3-乙酰胺基-1H-吡唑-1-基
4-(三氟甲基)-1H-1,2,3-三唑-1-基
3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基
4-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基
4-(三氟甲基)-1H-咪唑-1-基
4-氟-1H-吡唑-1-基
3-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基
4-(三氟甲基)-2H-1,2,3-三唑-2-基

[0453]

4-甲基-1H-吡唑-1-基
1H-咪唑-1-基
3-甲基-1H-吡唑-1-基
3-(甲基磺酰基)-1H-吡唑-1-基
(吡啶-2-基羰基)氨基
[2-甲基-3-(甲基亚磺酰基)丙酰基]氨基
[(甲基硫烷基)乙酰基]氨基
[2-甲基-3-(甲基磺酰基)丙酰基]氨基
[(甲基磺酰基)乙酰基]氨基
[2-甲基-3-(甲基硫烷基)丙酰基]氨基
[(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)羰基]氨基
[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)羰基]氨基
(1,3-噻唑-2-基羰基)氨基
(1,3-噻唑-4-基羰基)氨基
{[2-(三氟甲基)-1,3-噻唑-4-基]羰基}氨基
硫代乙酰基氨基
甲基氨基
二甲基氨基
乙基氨基
1-甲基胍基
胍基
1,2-二甲基胍基
(甲氧基羰基)氨基
氨基甲酰基氨基
(乙基氨基甲酰基)氨基
甲基氧基
乙基氧基
氨基甲酰基
甲基氨基甲酰基
乙基氨基甲酰基
(甲基氨基)硫代羰基(carbonothioyl)

	丙-1-烯-1-基
	2-环丙基乙烯基
	2-苯基乙烯基
	2-(4-氯苯基)乙烯基
	4-氯-3-(五氟乙基)-1H-吡唑-1-基
	3-环丙基-1H-吡唑-1-基
	3-[(甲基磺酰基)甲基]-1H-吡唑-1-基
	3-[(甲基亚磺酰基)甲基]-1H-吡唑-1-基
	4-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基
[0454]	3-(甲基硫烷基)-1H-1,2,4-三唑-1-基
	1,3-二甲基-5-氧代-1,5-二氢-4H-1,2,4-三唑-4-基
	4-甲基-5-氧代-4,5-二氢-1H-四唑-1-基
	5-氧代-4-(2,2,2-三氟乙基)-4,5-二氢-1H-四唑-1-基
	5-氧代-4-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4,5-二氢-1H-四唑-1-基
	2-氧代-1,3-噻唑烷-3-基
	5-氯吡啶-2-基
	2-氯-1-甲基-1H-咪唑-5-基
	1H-吡咯-3-基
	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	氧杂环丁烷-3-基氨基

[0455] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H2且R²具有表1中给出的含义且R¹、R³、R⁵、R⁶、R⁷、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0456] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H3且R²具有表1中给出的含义且R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0457] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H4且R²具有表1中给出的含义且R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

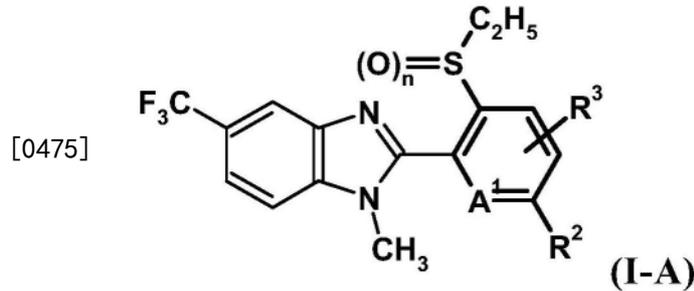
[0458] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H5, R²具有表1中给出的含义且R¹、R³、R⁵、R⁶、A¹和n具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0459] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H6, R²具有表1

中给出的含义且 R^1 、 R^3 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0473] 在一个优选的实施方案中,本发明涉及式(I)的化合物,其中X表示H₂O且 R^2 具有表1中给出的含义且 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 和 n 具有构型(3-1)或构型(3-2)或构型(4-1)或构型(4-2)或构型(5-1)或构型(5-2)或构型(6-1)或构型(6-2a)或构型(6-2b)中给出的含义。

[0474] 此外,可特别提及以下式(I-A)的化合物:



[0476] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0477] 表2:

[0478]

A^1	R^2	R^3	n
N	乙酰基氨基	H	0
N	丙酰基氨基	H	0
N	环丙烷羰基氨基	H	0
N	(2-环丙基乙酰基)氨基	H	0
N	2-甲基丙酰基氨基	H	0
N	(2-甲氧基乙酰基)氨基	H	0
N	苯甲酰胺基	H	0
N	(2,2-二氟乙酰基)氨基	H	0
N	(2,2,2-三氟乙酰基)氨基	H	0
N	2,2,3,3,3-五氟丙酰基氨基	H	0
N	2,2,3,3-四氟丙酰基氨基	H	0
N	甲氧基羰基	H	0
N	氨基	H	0
N	吗啉-4-基	H	0
N	3-[(三氟甲基)硫烷基]-1H-吡咯-1-基	H	0
N	4-(甲基磺酰基)-1H-吡唑-1-基	H	0
N	3-(甲基氨基甲酰基)-1H-吡唑-1-基	H	0
N	4-(甲基氨基甲酰基)-1H-吡唑-1-基	H	0
N	3-(甲基磺酰基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	0

[0479]

N	4-氯-1H-吡唑-1-基	H	0
N	3-氯-1H-吡唑-1-基	H	0
N	4-碘-1H-吡唑-1-基	H	0
N	3-碘-1H-吡唑-1-基	H	0
N	3-氟-1H-吡唑-1-基	H	0
N	4-溴-1H-吡唑-1-基	H	0
N	3-溴-1H-吡唑-1-基	H	0
N	3-(氟基甲基)-1H-吡唑-1-基	H	0
N	3-(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	H	0
N	3-(甲氧基甲基)-1H-吡唑-1-基	H	0
N	3-乙酰胺基-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	0
N	4-环丙基-1H-吡唑-1-基	H	0
N	4-碘-1H-咪唑-1-基	H	0
N	3-(甲基硫烷基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	0
N	4-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基	H	0
N	2H-1,2,3-三唑-2-基	H	0
N	1H-1,2,4-三唑-1-基	H	0
N	3-氯-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	0
N	4-氟基-1H-吡唑-1-基	H	0
N	3-噻吩基	H	0
N	1H-吡唑-1-基	H	0
N	3-氟基-1H-吡唑-1-基	H	0
N	3-乙酰胺基-1H-吡唑-1-基	H	0
N	4-(三氟甲基)-1H-1,2,3-三唑-1-基	H	0
N	3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基	H	0
N	4-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基	H	0
N	4-(三氟甲基)-1H-咪唑-1-基	H	0
N	4-氟-1H-吡唑-1-基	H	0
N	3-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基	H	0
N	4-(三氟甲基)-2H-1,2,3-三唑-2-基	H	0
N	4-甲基-1H-吡唑-1-基	H	0
N	1H-咪唑-1-基	H	0
N	3-甲基-1H-吡唑-1-基	H	0
N	3-(甲基磺酰基)-1H-吡唑-1-基	H	0

[0480]

N	(吡啶-2-基羰基)氨基	H	0
N	[2-甲基-3-(甲基亚磺酰基)丙酰基]氨基	H	0
N	[(甲基硫烷基)乙酰基]氨基	H	0
N	[2-甲基-3-(甲基磺酰基)丙酰基]氨基	H	0
N	[(甲基磺酰基)乙酰基]氨基	H	0
N	[2-甲基-3-(甲基硫烷基)丙酰基]氨基	H	0
N	[(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)羰基]氨基	H	0
N	[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)羰基]氨基	H	0
N	(1,3-噻唑-2-基羰基)氨基	H	0
N	(1,3-噻唑-4-基羰基)氨基	H	0
N	{[2-(三氟甲基)-1,3-噻唑-4-基]羰基}氨基	H	0
N	硫代乙酰基氨基	H	0
N	甲基氨基	H	0
N	二甲基氨基	H	0
N	乙基氨基	H	0
N	1-甲基胍基	H	0
N	胍基	H	0
N	1,2-二甲基胍基	H	0
N	(甲氧基羰基)氨基	H	0
N	氨基甲酰基氨基	H	0
N	(乙基氨基甲酰基)氨基	H	0
N	甲基氧基	H	0
N	乙基氧基	H	0
N	氨基甲酰基	H	0
N	甲基氨基甲酰基	H	0
N	乙基氨基甲酰基	H	0
N	(甲基氨基)硫代羰基	H	0
N	丙-1-烯-1-基	H	0
N	2-环丙基乙烯基	H	0
N	2-苯基乙烯基	H	0
N	2-(4-氯苯基)乙烯基	H	0
N	4-氯-3-(五氟乙基)-1H-吡唑-1-基	H	0
N	3-环丙基-1H-吡唑-1-基	H	0
N	3-[(甲基磺酰基)甲基]-1H-吡唑-1-基	H	0

[0481]

N	3-[(甲基亚磺酰基)甲基]-1H-吡唑-1-基	H	0
N	4-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基	H	0
N	3-(甲基硫烷基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	0
N	1,3-二甲基-5-氧代-1,5-二氢-4H-1,2,4-三唑-4-基	H	0
N	4-甲基-5-氧代-4,5-二氢-1H-四唑-1-基	H	0
N	5-氧代-4-(2,2,2-三氟乙基)-4,5-二氢-1H-四唑-1-基	H	0
N	5-氧代-4-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4,5-二氢-1H-四唑-1-基	H	0
N	2-氧代-1,3-噻唑烷-3-基	H	0
N	5-氟吡啶-2-基	H	0
N	2-氟-1-甲基-1H-咪唑-5-基	H	0
N	1H-吡咯-3-基	H	0
N	1-甲基-1H-吡唑-4-基	H	0
N	氧杂环丁烷-3-基氨基	H	0
N	乙酰基氨基	H	1
N	丙酰基氨基	H	1
N	环丙烷羰基氨基	H	1
N	(2-环丙基乙酰基)氨基	H	1
N	2-甲基丙酰基氨基	H	1
N	(2-甲氧基乙酰基)氨基	H	1
N	苯甲酰胺基	H	1
N	(2,2-二氟乙酰基)氨基	H	1
N	(2,2,2-三氟乙酰基)氨基	H	1
N	2,2,3,3,3-五氟丙酰基氨基	H	1
N	2,2,3,3-四氟丙酰基氨基	H	1
N	甲氧基羰基	H	1
N	氨基	H	1
N	吗啉-4-基	H	1
N	3-[(三氟甲基)硫烷基]-1H-吡咯-1-基	H	1
N	4-(甲基磺酰基)-1H-吡唑-1-基	H	1
N	3-(甲基氨基甲酰基)-1H-吡唑-1-基	H	1
N	4-(甲基氨基甲酰基)-1H-吡唑-1-基	H	1

[0482]

N	3-(甲基磺酰基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	1
N	4-氯-1H-吡唑-1-基	H	1
N	3-氯-1H-吡唑-1-基	H	1
N	4-碘-1H-吡唑-1-基	H	1
N	3-碘-1H-吡唑-1-基	H	1
N	3-氟-1H-吡唑-1-基	H	1
N	4-溴-1H-吡唑-1-基	H	1
N	3-溴-1H-吡唑-1-基	H	1
N	3-(氟基甲基)-1H-吡唑-1-基	H	1
N	3-(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	H	1
N	3-(甲氧基甲基)-1H-吡唑-1-基	H	1
N	3-乙酰胺基-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	1
N	4-环丙基-1H-吡唑-1-基	H	1
N	4-碘-1H-咪唑-1-基	H	1
N	3-(甲基硫烷基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	1
N	4-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基	H	1
N	2H-1,2,3-三唑-2-基	H	1
N	1H-1,2,4-三唑-1-基	H	1
N	3-氯-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	1
N	4-氟基-1H-吡唑-1-基	H	1
N	3-噻吩基	H	1
N	1H-吡唑-1-基	H	1
N	3-氟基-1H-吡唑-1-基	H	1
N	3-乙酰胺基-1H-吡唑-1-基	H	1
N	4-(三氟甲基)-1H-1,2,3-三唑-1-基	H	1
N	3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基	H	1
N	4-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基	H	1
N	4-(三氟甲基)-1H-咪唑-1-基	H	1
N	4-氟-1H-吡唑-1-基	H	1
N	3-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基	H	1
N	4-(三氟甲基)-2H-1,2,3-三唑-2-基	H	1
N	4-甲基-1H-吡唑-1-基	H	1
N	1H-咪唑-1-基	H	1
N	3-甲基-1H-吡唑-1-基	H	1

[0483]

N	3-(甲基磺酰基)-1H-吡唑-1-基	H	1
N	(吡啶-2-基羰基)氨基	H	1
N	[2-甲基-3-(甲基亚磺酰基)丙酰基]氨基	H	1
N	[(甲基硫烷基)乙酰基]氨基	H	1
N	[2-甲基-3-(甲基磺酰基)丙酰基]氨基	H	1
N	[(甲基磺酰基)乙酰基]氨基	H	1
N	[2-甲基-3-(甲基硫烷基)丙酰基]氨基	H	1
N	[(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)羰基]氨基	H	1
N	[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)羰基]氨基	H	1
N	(1,3-噻唑-2-基羰基)氨基	H	1
N	(1,3-噻唑-4-基羰基)氨基	H	1
N	{[2-(三氟甲基)-1,3-噻唑-4-基]羰基}氨基	H	1
N	硫代乙酰基氨基	H	1
N	甲基氨基	H	1
N	二甲基氨基	H	1
N	乙基氨基	H	1
N	1-甲基胍基	H	1
N	胍基	H	1
N	1,2-二甲基胍基	H	1
N	(甲氧基羰基)氨基	H	1
N	氨基甲酰基氨基	H	1
N	(乙基氨基甲酰基)氨基	H	1
N	甲基氧基	H	1
N	乙基氧基	H	1
N	氨基甲酰基	H	1
N	甲基氨基甲酰基	H	1
N	乙基氨基甲酰基	H	1
N	(甲基氨基)硫代羰基	H	1
N	丙-1-烯-1-基	H	1
N	2-环丙基乙烯基	H	1
N	2-苯基乙烯基	H	1
N	2-(4-氯苯基)乙烯基	H	1
N	4-氯-3-(五氟乙基)-1H-吡唑-1-基	H	1
N	3-环丙基-1H-吡唑-1-基	H	1

[0484]

N	3-[(甲基磺酰基)甲基]-1H-吡唑-1-基	H	1
N	3-[(甲基亚磺酰基)甲基]-1H-吡唑-1-基	H	1
N	4-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基	H	1
N	3-(甲基硫烷基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	1
N	1,3-二甲基-5-氧代-1,5-二氢-4H-1,2,4-三唑-4-基	H	1
N	4-甲基-5-氧代-4,5-二氢-1H-四唑-1-基	H	1
N	5-氧代-4-(2,2,2-三氟乙基)-4,5-二氢-1H-四唑-1-基	H	1
N	5-氧代-4-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4,5-二氢-1H-四唑-1-基	H	1
N	2-氧代-1,3-噻唑烷-3-基	H	1
N	5-氯代吡啶-2-基	H	1
N	2-氯-1-甲基-1H-咪唑-5-基	H	1
N	1H-吡咯-3-基	H	1
N	1-甲基-1H-吡唑-4-基	H	1
N	氧杂环丁烷-3-基氨基	H	1
N	乙酰基氨基	H	2
N	丙酰基氨基	H	2
N	环丙烷羰基氨基	H	2
N	(2-环丙基乙酰基)氨基	H	2
N	2-甲基丙酰基氨基	H	2
N	(2-甲氧基乙酰基)氨基	H	2
N	苯甲酰胺基	H	2
N	(2,2-二氟乙酰基)氨基	H	2
N	(2,2,2-三氟乙酰基)氨基	H	2
N	2,2,3,3,3-五氟丙酰基氨基	H	2
N	2,2,3,3-四氟丙酰基氨基	H	2
N	甲氧基羰基	H	2
N	氨基	H	2
N	吗啉-4-基	H	2
N	3-[(三氟甲基)硫烷基]-1H-吡咯-1-基	H	2
N	4-(甲基磺酰基)-1H-吡唑-1-基	H	2
N	3-(甲基氨基甲酰基)-1H-吡唑-1-基	H	2

[0485]

N	4-(甲基氨基甲酰基)-1H-吡唑-1-基	H	2
N	3-(甲基磺酰基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	2
N	4-氟-1H-吡唑-1-基	H	2
N	3-氟-1H-吡唑-1-基	H	2
N	4-碘-1H-吡唑-1-基	H	2
N	3-碘-1H-吡唑-1-基	H	2
N	3-氟-1H-吡唑-1-基	H	2
N	4-溴-1H-吡唑-1-基	H	2
N	3-溴-1H-吡唑-1-基	H	2
N	3-(氟基甲基)-1H-吡唑-1-基	H	2
N	3-(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	H	2
N	3-(甲氧基甲基)-1H-吡唑-1-基	H	2
N	3-乙酰氨基-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	2
N	4-环丙基-1H-吡唑-1-基	H	2
N	4-碘-1H-咪唑-1-基	H	2
N	3-(甲基硫烷基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	2
N	4-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基	H	2
N	2H-1,2,3-三唑-2-基	H	2
N	1H-1,2,4-三唑-1-基	H	2
N	3-氟-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	2
N	4-氟基-1H-吡唑-1-基	H	2
N	3-噻吩基	H	2
N	1H-吡唑-1-基	H	2
N	3-氟基-1H-吡唑-1-基	H	2
N	3-乙酰氨基-1H-吡唑-1-基	H	2
N	4-(三氟甲基)-1H-1,2,3-三唑-1-基	H	2
N	3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基	H	2
N	4-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基	H	2
N	4-(三氟甲基)-1H-咪唑-1-基	H	2
N	4-氟-1H-吡唑-1-基	H	2
N	3-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基	H	2
N	4-(三氟甲基)-2H-1,2,3-三唑-2-基	H	2
N	4-甲基-1H-吡唑-1-基	H	2
N	1H-咪唑-1-基	H	2

[0486]

N	3-甲基-1H-吡唑-1-基	H	2
N	3-(甲基磺酰基)-1H-吡唑-1-基	H	2
N	(吡啶-2-基羰基)氨基	H	2
N	[2-甲基-3-(甲基亚磺酰基)丙酰基]氨基	H	2
N	[(甲基硫烷基)乙酰基]氨基	H	2
N	[2-甲基-3-(甲基磺酰基)丙酰基]氨基	H	2
N	[(甲基磺酰基)乙酰基]氨基	H	2
N	[2-甲基-3-(甲基硫烷基)丙酰基]氨基	H	2
N	[(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)羰基]氨基	H	2
N	[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)羰基]氨基	H	2
N	(1,3-噻唑-2-基羰基)氨基	H	2
N	(1,3-噻唑-4-基羰基)氨基	H	2
N	{[2-(三氟甲基)-1,3-噻唑-4-基]羰基}氨基	H	2
N	硫代乙酰基氨基	H	2
N	甲基氨基	H	2
N	二甲基氨基	H	2
N	乙基氨基	H	2
N	1-甲基胍基	H	2
N	胍基	H	2
N	1,2-二甲基胍基	H	2
N	(甲氧基羰基)氨基	H	2
N	氨基甲酰基氨基	H	2
N	(乙基氨基甲酰基)氨基	H	2
N	甲基氧基	H	2
N	乙基氧基	H	2
N	氨基甲酰基	H	2
N	甲基氨基甲酰基	H	2
N	乙基氨基甲酰基	H	2
N	(甲基氨基)硫代羰基	H	2
N	丙-1-烯-1-基	H	2
N	2-环丙基乙烯基	H	2
N	2-苯基乙烯基	H	2
N	2-(4-氟苯基)乙烯基	H	2
N	4-氟-3-(五氟乙基)-1H-吡唑-1-基	H	2

[0487]

N	3-环丙基-1H-吡唑-1-基	H	2
N	3-[(甲基磺酰基)甲基]-1H-吡唑-1-基	H	2
N	3-[(甲基亚磺酰基)甲基]-1H-吡唑-1-基	H	2
N	4-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基	H	2
N	3-(甲基硫烷基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	2
N	1,3-二甲基-5-氧代-1,5-二氢-4H-1,2,4-三唑-4-基	H	2
N	4-甲基-5-氧代-4,5-二氢-1H-四唑-1-基	H	2
N	5-氧代-4-(2,2,2-三氟乙基)-4,5-二氢-1H-四唑-1-基	H	2
N	5-氧代-4-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4,5-二氢-1H-四唑-1-基	H	2
N	2-氧代-1,3-噻唑烷-3-基	H	2
N	5-氯吡啶-2-基	H	2
N	2-氯-1-甲基-1H-咪唑-5-基	H	2
N	1H-吡咯-3-基	H	2
N	1-甲基-1H-吡唑-4-基	H	2
N	氧杂环丁烷-3-基氨基	H	2
C-H	乙酰基氨基	H	0
C-H	丙酰基氨基	H	0
C-H	环丙烷羰基氨基	H	0
C-H	(2-环丙基乙酰基)氨基	H	0
C-H	2-甲基丙酰基氨基	H	0
C-H	(2-甲氧基乙酰基)氨基	H	0
C-H	苯甲酰胺基	H	0
C-H	(2,2-二氟乙酰基)氨基	H	0
C-H	(2,2,2-三氟乙酰基)氨基	H	0
C-H	2,2,3,3,3-五氟丙酰基氨基	H	0
C-H	2,2,3,3-四氟丙酰基氨基	H	0
C-H	甲氧基羰基	H	0
C-H	氨基	H	0
C-H	吗啉-4-基	H	0
C-H	3-[(三氟甲基)硫烷基]-1H-吡咯-1-基	H	0
C-H	4-(甲基磺酰基)-1H-吡唑-1-基	H	0

[0488]

C-H	3-(甲基氨基甲酰基)-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	4-(甲基氨基甲酰基)-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	3-(甲基磺酰基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	0
C-H	4-氟-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	3-氟-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	4-碘-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	3-碘-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	3-氟-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	4-溴-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	3-溴-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	3-(氟基甲基)-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	3-(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	3-(甲氧基甲基)-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	3-乙酰胺基-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	0
C-H	4-环丙基-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	4-碘-1H-咪唑-1-基	H	0
C-H	3-(甲基硫烷基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	0
C-H	4-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	2H-1,2,3-三唑-2-基	H	0
C-H	1H-1,2,4-三唑-1-基	H	0
C-H	3-氟-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	0
C-H	4-氟基-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	3-噻吩基	H	0
C-H	1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	3-氟基-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	3-乙酰胺基-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	4-(三氟甲基)-1H-1,2,3-三唑-1-基	H	0
C-H	3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	4-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	4-(三氟甲基)-1H-咪唑-1-基	H	0
C-H	4-氟-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	3-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	4-(三氟甲基)-2H-1,2,3-三唑-2-基	H	0
C-H	4-甲基-1H-吡唑-1-基	H	0

[0489]

C-H	1H-咪唑-1-基	H	0
C-H	3-甲基-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	3-(甲基磺酰基)-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	(吡啶-2-基羰基)氨基	H	0
C-H	[2-甲基-3-(甲基亚磺酰基)丙酰基]氨基	H	0
C-H	[(甲基硫烷基)乙酰基]氨基	H	0
C-H	[2-甲基-3-(甲基磺酰基)丙酰基]氨基	H	0
C-H	[(甲基磺酰基)乙酰基]氨基	H	0
C-H	[2-甲基-3-(甲基硫烷基)丙酰基]氨基	H	0
C-H	[(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)羰基]氨基	H	0
C-H	[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)羰基]氨基	H	0
C-H	(1,3-噻唑-2-基羰基)氨基	H	0
C-H	(1,3-噻唑-4-基羰基)氨基	H	0
C-H	{[2-(三氟甲基)-1,3-噻唑-4-基]羰基}氨基	H	0
C-H	硫代乙酰基氨基	H	0
C-H	甲基氨基	H	0
C-H	二甲基氨基	H	0
C-H	乙基氨基	H	0
C-H	1-甲基胍基	H	0
C-H	胍基	H	0
C-H	1,2-二甲基胍基	H	0
C-H	(甲氧基羰基)氨基	H	0
C-H	氨基甲酰基氨基	H	0
C-H	(乙基氨基甲酰基)氨基	H	0
C-H	甲基氧基	H	0
C-H	乙基氧基	H	0
C-H	氨基甲酰基	H	0
C-H	甲基氨基甲酰基	H	0
C-H	乙基氨基甲酰基	H	0
C-H	(甲基氨基)硫代羰基	H	0
C-H	丙-1-烯-1-基	H	0
C-H	2-环丙基乙烯基	H	0
C-H	2-苯基乙烯基	H	0
C-H	2-(4-氯苯基)乙烯基	H	0

[0490]

C-H	4-氯-3-(五氟乙基)-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	3-环丙基-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	3-[(甲基磺酰基)甲基]-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	3-[(甲基亚磺酰基)甲基]-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	4-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基	H	0
C-H	3-(甲基硫烷基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	0
C-H	1,3-二甲基-5-氧代-1,5-二氢-4H-1,2,4-三唑-4-基	H	0
C-H	4-甲基-5-氧代-4,5-二氢-1H-四唑-1-基	H	0
C-H	5-氧代-4-(2,2,2-三氟乙基)-4,5-二氢-1H-四唑-1-基	H	0
C-H	5-氧代-4-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4,5-二氢-1H-四唑-1-基	H	0
C-H	2-氧代-1,3-噻唑烷-3-基	H	0
C-H	5-氯吡啶-2-基	H	0
C-H	2-氯-1-甲基-1H-咪唑-5-基	H	0
C-H	1H-吡咯-3-基	H	0
C-H	1-甲基-1H-吡唑-4-基	H	0
C-H	氧杂环丁烷-3-基氨基	H	0
C-H	乙酰基氨基	H	1
C-H	丙酰基氨基	H	1
C-H	环丙烷羰基氨基	H	1
C-H	(2-环丙基乙酰基)氨基	H	1
C-H	2-甲基丙酰基氨基	H	1
C-H	(2-甲氧基乙酰基)氨基	H	1
C-H	苯甲酰胺基	H	1
C-H	(2,2-二氟乙酰基)氨基	H	1
C-H	(2,2,2-三氟乙酰基)氨基	H	1
C-H	2,2,3,3,3-五氟丙酰基氨基	H	1
C-H	2,2,3,3-四氟丙酰基氨基	H	1
C-H	甲氧基羰基	H	1
C-H	氨基	H	1
C-H	吗啉-4-基	H	1
C-H	3-[(三氟甲基)硫烷基]-1H-吡咯-1-基	H	1

[0491]

C-H	4-(甲基磺酰基)-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-(甲基氨基甲酰基)-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	4-(甲基氨基甲酰基)-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-(甲基磺酰基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	1
C-H	4-氯-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-氯-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	4-碘-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-碘-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-氟-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	4-溴-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-溴-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-(氟基甲基)-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-(甲氧基甲基)-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-乙酰胺基-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	1
C-H	4-环丙基-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	4-碘-1H-咪唑-1-基	H	1
C-H	3-(甲基硫烷基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	1
C-H	4-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	2H-1,2,3-三唑-2-基	H	1
C-H	1H-1,2,4-三唑-1-基	H	1
C-H	3-氯-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	1
C-H	4-氟基-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-噻吩基	H	1
C-H	1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-氟基-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-乙酰胺基-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	4-(三氟甲基)-1H-1,2,3-三唑-1-基	H	1
C-H	3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	4-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	4-(三氟甲基)-1H-咪唑-1-基	H	1
C-H	4-氟-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	4-(三氟甲基)-2H-1,2,3-三唑-2-基	H	1

[0492]

C-H	4-甲基-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	1H-咪唑-1-基	H	1
C-H	3-甲基-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-(甲基磺酰基)-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	(吡啶-2-基羰基)氨基	H	1
C-H	[2-甲基-3-(甲基亚磺酰基)丙酰基]氨基	H	1
C-H	[(甲基硫烷基)乙酰基]氨基	H	1
C-H	[2-甲基-3-(甲基磺酰基)丙酰基]氨基	H	1
C-H	[(甲基磺酰基)乙酰基]氨基	H	1
C-H	[2-甲基-3-(甲基硫烷基)丙酰基]氨基	H	1
C-H	[(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)羰基]氨基	H	1
C-H	[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)羰基]氨基	H	1
C-H	(1,3-噻唑-2-基羰基)氨基	H	1
C-H	(1,3-噻唑-4-基羰基)氨基	H	1
C-H	{[2-(三氟甲基)-1,3-噻唑-4-基]羰基}氨基	H	1
C-H	硫代乙酰基氨基	H	1
C-H	甲基氨基	H	1
C-H	二甲基氨基	H	1
C-H	乙基氨基	H	1
C-H	1-甲基胍基	H	1
C-H	胍基	H	1
C-H	1,2-二甲基胍基	H	1
C-H	(甲氧基羰基)氨基	H	1
C-H	氨基甲酰基氨基	H	1
C-H	(乙基氨基甲酰基)氨基	H	1
C-H	甲基氧基	H	1
C-H	乙基氧基	H	1
C-H	氨基甲酰基	H	1
C-H	甲基氨基甲酰基	H	1
C-H	乙基氨基甲酰基	H	1
C-H	(甲基氨基)硫代羰基	H	1
C-H	丙-1-烯-1-基	H	1
C-H	2-环丙基乙烯基	H	1
C-H	2-苯基乙烯基	H	1

[0493]

C-H	2-(4-氯苯基)乙烯基	H	1
C-H	4-氯-3-(五氟乙基)-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-环丙基-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-[(甲基磺酰基)甲基]-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-[(甲基亚磺酰基)甲基]-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	4-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基	H	1
C-H	3-(甲基硫烷基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	1
C-H	1,3-二甲基-5-氧代-1,5-二氢-4H-1,2,4-三唑-4-基	H	1
C-H	4-甲基-5-氧代-4,5-二氢-1H-四唑-1-基	H	1
C-H	5-氧代-4-(2,2,2-三氟乙基)-4,5-二氢-1H-四唑-1-基	H	1
C-H	5-氧代-4-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4,5-二氢-1H-四唑-1-基	H	1
C-H	2-氧代-1,3-噻唑烷-3-基	H	1
C-H	5-氯吡啶-2-基	H	1
C-H	2-氯-1-甲基-1H-咪唑-5-基	H	1
C-H	1H-吡咯-3-基	H	1
C-H	1-甲基-1H-吡唑-4-基	H	1
C-H	氧杂环丁烷-3-基氨基	H	1
C-H	乙酰基氨基	H	2
C-H	丙酰基氨基	H	2
C-H	环丙烷羰基氨基	H	2
C-H	(2-环丙基乙酰基)氨基	H	2
C-H	2-甲基丙酰基氨基	H	2
C-H	(2-甲氧基乙酰基)氨基	H	2
C-H	苯甲酰胺基	H	2
C-H	(2,2-二氟乙酰基)氨基	H	2
C-H	(2,2,2-三氟乙酰基)氨基	H	2
C-H	2,2,3,3,3-五氟丙酰基氨基	H	2
C-H	2,2,3,3-四氟丙酰基氨基	H	2
C-H	甲氧基羰基	H	2
C-H	氨基	H	2
C-H	吗啉-4-基	H	2

[0494]

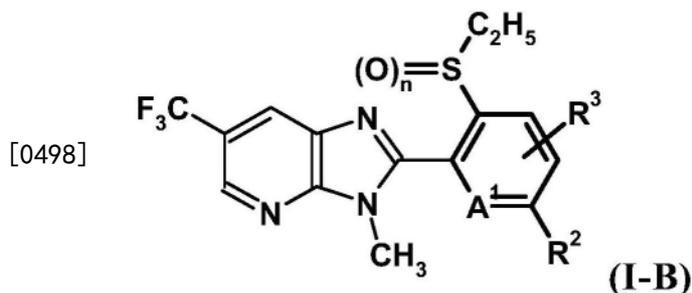
C-H	3-[(三氟甲基)硫烷基]-1H-吡咯-1-基	H	2
C-H	4-(甲基磺酰基)-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	3-(甲基氨基甲酰基)-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	4-(甲基氨基甲酰基)-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	3-(甲基磺酰基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	2
C-H	4-氯-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	3-氯-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	4-碘-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	3-碘-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	3-氟-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	4-溴-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	3-溴-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	3-(氟基甲基)-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	3-(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	3-(甲氧基甲基)-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	3-乙酰胺基-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	2
C-H	4-环丙基-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	4-碘-1H-咪唑-1-基	H	2
C-H	3-(甲基硫烷基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	2
C-H	4-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	2H-1,2,3-三唑-2-基	H	2
C-H	1H-1,2,4-三唑-1-基	H	2
C-H	3-氯-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	2
C-H	4-氟基-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	3-噻吩基	H	2
C-H	1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	3-氟基-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	3-乙酰胺基-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	4-(三氟甲基)-1H-1,2,3-三唑-1-基	H	2
C-H	3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	4-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	4-(三氟甲基)-1H-咪唑-1-基	H	2
C-H	4-氟-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	3-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基	H	2

[0495]

C-H	4-(三氟甲基)-2H-1,2,3-三唑-2-基	H	2
C-H	4-甲基-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	1H-咪唑-1-基	H	2
C-H	3-甲基-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	3-(甲基磺酰基)-1H-吡唑-1-基	H	2
C-H	(吡啶-2-基羰基)氨基	H	2
C-H	[2-甲基-3-(甲基亚磺酰基)丙酰基]氨基	H	2
C-H	[(甲基硫烷基)乙酰基]氨基	H	2
C-H	[2-甲基-3-(甲基磺酰基)丙酰基]氨基	H	2
C-H	[(甲基磺酰基)乙酰基]氨基	H	2
C-H	[2-甲基-3-(甲基硫烷基)丙酰基]氨基	H	2
C-H	[(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)羰基]氨基	H	2
C-H	[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)羰基]氨基	H	2
C-H	(1,3-噻唑-2-基羰基)氨基	H	2
C-H	(1,3-噻唑-4-基羰基)氨基	H	2
C-H	{[2-(三氟甲基)-1,3-噻唑-4-基]羰基}氨基	H	2
C-H	硫代乙酰基氨基	H	2
C-H	甲基氨基	H	2
C-H	二甲基氨基	H	2
C-H	乙基氨基	H	2
C-H	1-甲基胍基	H	2
C-H	胍基	H	2
C-H	1,2-二甲基胍基	H	2
C-H	(甲氧基羰基)氨基	H	2
C-H	氨基甲酰基氨基	H	2
C-H	(乙基氨基甲酰基)氨基	H	2
C-H	甲基氧基	H	2
C-H	乙基氧基	H	2
C-H	氨基甲酰基	H	2
C-H	甲基氨基甲酰基	H	2
C-H	乙基氨基甲酰基	H	2
C-H	(甲基氨基)硫代羰基	H	2
C-H	丙-1-烯-1-基	H	2
C-H	2-环丙基乙烯基	H	2

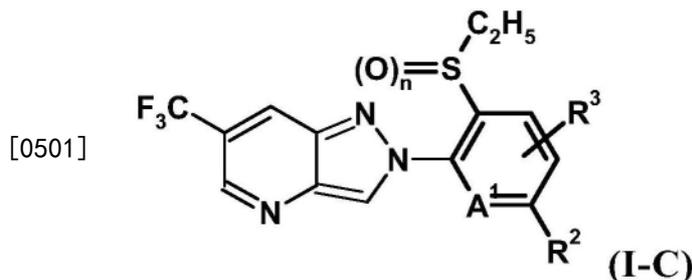
	C-H	2-苯基乙烯基	H	2
	C-H	2-(4-氯苯基)乙烯基	H	2
	C-H	4-氯-3-(五氟乙基)-1H-吡唑-1-基	H	2
	C-H	3-环丙基-1H-吡唑-1-基	H	2
	C-H	3-[(甲基磺酰基)甲基]-1H-吡唑-1-基	H	2
	C-H	3-[(甲基亚磺酰基)甲基]-1H-吡唑-1-基	H	2
	C-H	4-(甲基硫烷基)-1H-吡唑-1-基	H	2
	C-H	3-(甲基硫烷基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	H	2
	C-H	1,3-二甲基-5-氧代-1,5-二氢-4H-1,2,4-三唑-4-基	H	2
[0496]	C-H	4-甲基-5-氧代-4,5-二氢-1H-四唑-1-基	H	2
	C-H	5-氧代-4-(2,2,2-三氟乙基)-4,5-二氢-1H-四唑-1-基	H	2
	C-H	5-氧代-4-(2,2,3,3,3-五氟丙基)-4,5-二氢-1H-四唑-1-基	H	2
	C-H	2-氧代-1,3-噻唑烷-3-基	H	2
	C-H	5-氯吡啶-2-基	H	2
	C-H	2-氯-1-甲基-1H-咪唑-5-基	H	2
	C-H	1H-吡咯-3-基	H	2
	C-H	1-甲基-1H-吡唑-4-基	H	2
	C-H	氧杂环丁烷-3-基氨基	H	2

[0497] 此外,可特别提及以下式(I-B)的化合物:



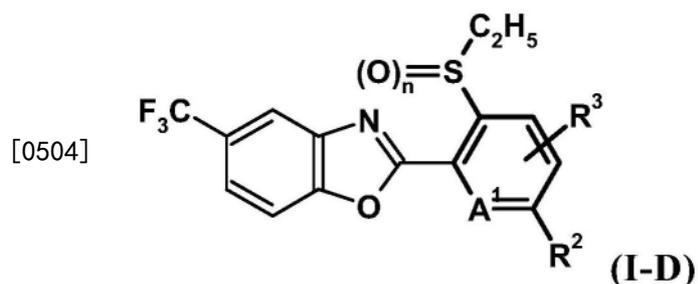
[0499] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0500] 此外,可特别提及以下式(I-C)的化合物:



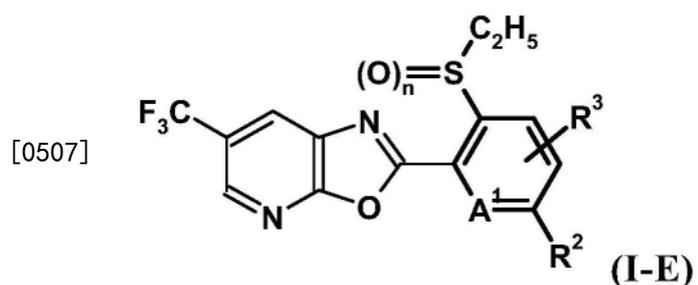
[0502] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0503] 此外,可特别提及以下式(I-D)的化合物:



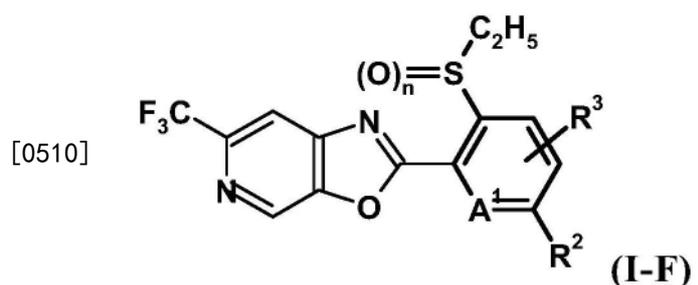
[0505] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0506] 此外,可特别提及以下式(I-E)的化合物:



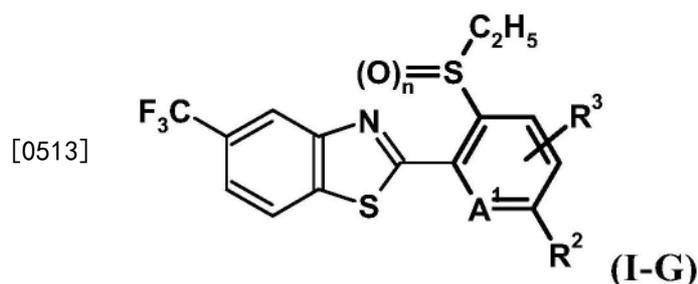
[0508] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0509] 此外,可特别提及以下式(I-F)的化合物:



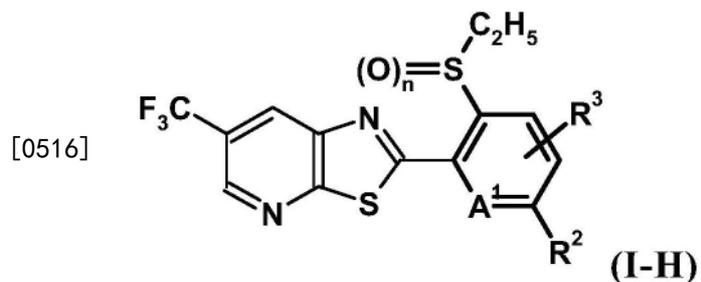
[0511] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0512] 此外,可特别提及以下式(I-G)的化合物:



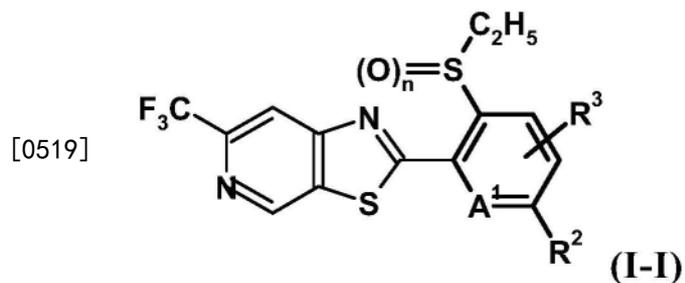
[0514] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0515] 此外,可特别提及以下式(I-H)的化合物:



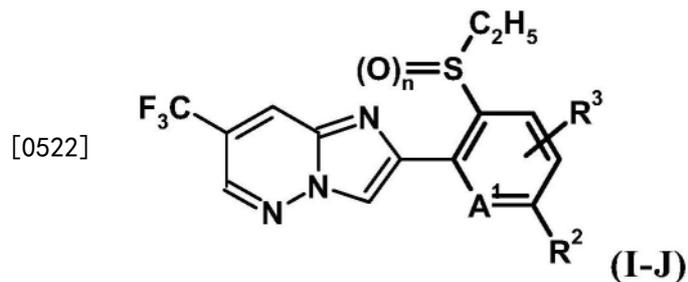
[0517] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0518] 此外,可特别提及以下式 (I-I) 的化合物:



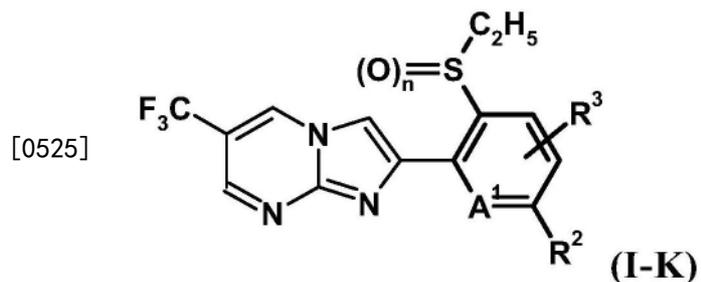
[0520] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0521] 此外,可特别提及以下式 (I-J) 的化合物:



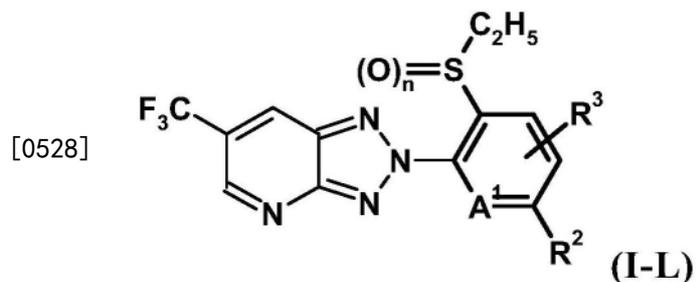
[0523] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0524] 此外,可特别提及以下式 (I-K) 的化合物:



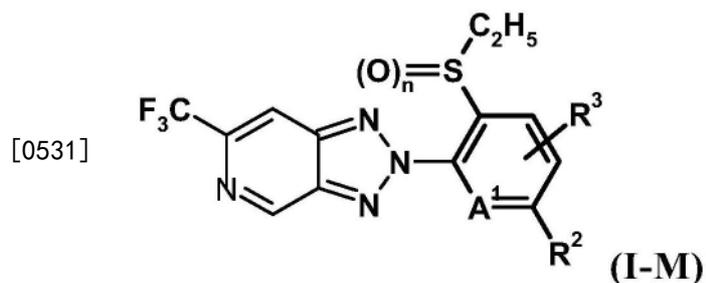
[0526] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0527] 此外,可特别提及以下式 (I-L) 的化合物:



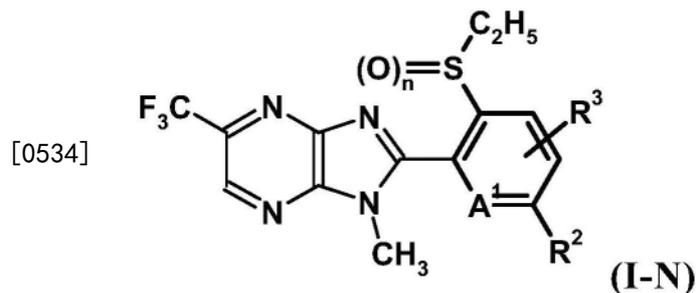
[0529] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0530] 此外,可特别提及以下式 (I-M) 的化合物:



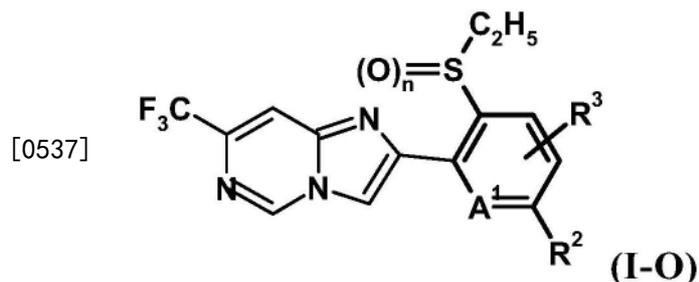
[0532] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0533] 此外,可特别提及以下式 (I-N) 的化合物:



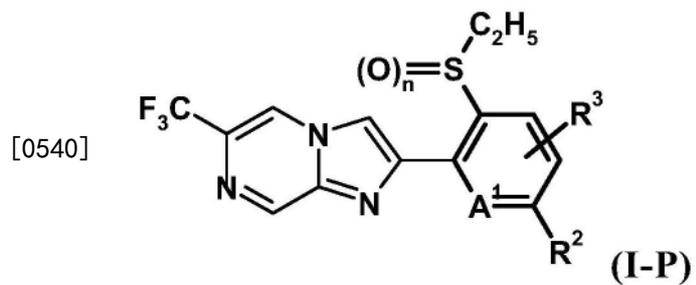
[0535] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0536] 此外,可特别提及以下式 (I-O) 的化合物:



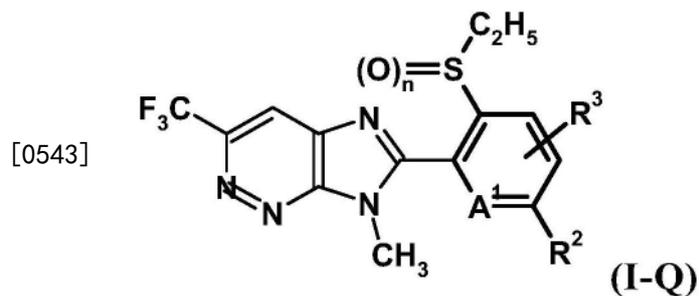
[0538] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0539] 此外,可特别提及以下式 (I-P) 的化合物:



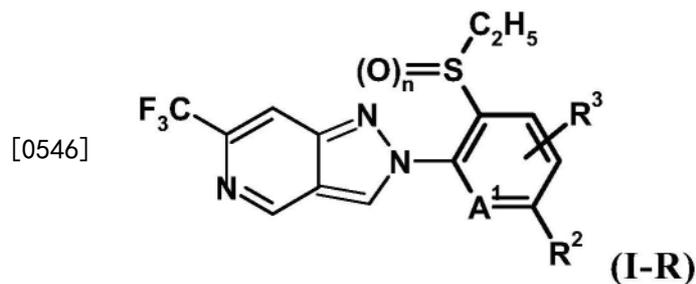
[0541] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0542] 此外,可特别提及以下式 (I-Q) 的化合物:



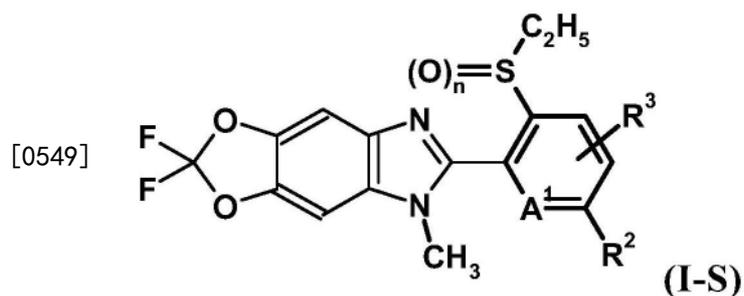
[0544] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0545] 此外,可特别提及以下式 (I-R) 的化合物:



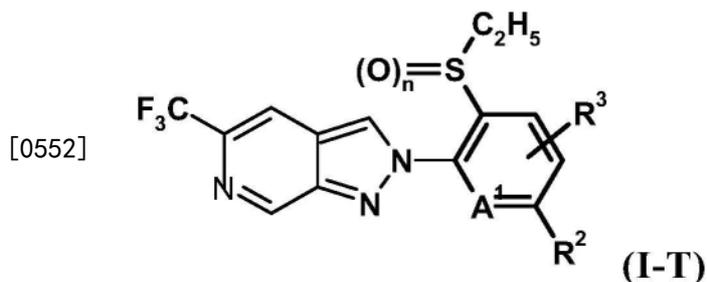
[0547] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0548] 此外,可特别提及以下式 (I-S) 的化合物:



[0550] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0551] 此外,可特别提及以下式 (I-T) 的化合物:



[0553] A^1 、 R^2 、 R^3 和 n 如表2所示。

[0554] 除非另有说明,在优选的定义中,

[0555] 卤素选自氟、氯、溴和碘,依次优选选自氟、氯和溴。

[0556] 芳基(包括作为更大单元的一部分,例如芳基烷基)选自苯基、萘基、蒽基、菲基,并且依次优选表示苯基,

[0557] 杂芳基(hetaryl)(与杂芳基(heteroaryl)同义,包括作为更大单元的一部分,例如杂芳基烷基)选自呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、三唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、1,2,3-噁二唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,5-噁二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,2,5-噻二唑基、四唑基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、1,2,3-三嗪基、1,2,4-三嗪基、1,3,5-三嗪基、苯并呋喃基、苯并异呋喃基、苯并噻吩基、苯并异噻吩基、吲哚基、异吲哚基、吲唑基、苯并噻唑基、苯并异噻唑基、苯并噁唑基、苯并异噁唑基、苯并咪唑基、2,1,3-苯并噁二唑、喹啉基、异喹啉基、噌啉基、酞嗪基、喹唑啉基、喹喔啉基、茶啉基、苯并三嗪基、嘌呤基、蝶啶基和吡嗪基,

[0558] 杂环基表示含有1或2个氮原子和/或一个氧原子和/或一个硫原子的饱和4元、5元或6元环,例如氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、氧杂环丁烷基、四氢呋喃基、四氢吡喃基、二噁烷基、硫杂环丁烷基、四氢噻吩基、四氢硫代吡喃基、哌嗪基、吗啉基和硫代吗啉基。

[0559] 除非另有说明,在特别优选的定义中,

[0560] 卤素选自氟、氯、溴和碘,依次优选选自氟、氯和溴。

[0561] 芳基(包括作为更大单元的一部分,例如芳基烷基)选自苯基、萘基、蒽基、菲基,并且依次优选表示苯基,

[0562] 杂芳基(包括作为更大单元的一部分,例如杂芳基烷基)选自吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、哒嗪基、吡唑基、咪唑基、三唑基、噻唑基和四唑基,

[0563] 杂环基选自氧杂环丁烷基、四氢呋喃基和哌嗪基。

[0564] 在本发明的上下文中,除非另有定义,术语“烷基”本身或与其他术语例如卤代烷基组合应理解是指饱和脂族烃基的基团,其具有1至12个碳原子并且可以是支化的或非支化的。 C_1 - C_{12} -烷基的实例为甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、正戊基、异戊基、新戊基、叔戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、1-乙基丙基、1,2-二甲基丙基、己基、正庚基、正辛基、正壬基、正癸基、正十一烷基和正十二烷基。从这些烷基中,特别优选 C_1 - C_6 -烷基。特别优选 C_1 - C_4 -烷基。

[0565] 根据本发明,除非另有定义,术语“烯基”本身或与其他术语组合应理解是指具有至少一个双键的直链或支链 C_2 - C_{12} -烯基,例如乙烯基、烯丙基、1-丙烯基、异丙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1,3-丁二烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1,3-戊二烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基和1,4-己二烯基。其中优选

C₂-C₆-烯基,特别优选C₂-C₄-烯基。

[0566] 根据本发明,除非另有定义,术语“炔基”本身或与其他术语组合应理解为是指具有至少一个三键的直链或支链C₂-C₁₂-炔基,例如乙炔基、1-丙炔基和炔丙基。其中,优选C₃-C₆-炔基,特别优选C₃-C₄-炔基。炔基还可以含有至少一个双键。

[0567] 根据本发明,除非另有定义,术语“环烷基”本身或与其他术语组合应理解为是指C₃-C₈-环烷基,例如环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基和环辛基。其中,优选C₃-C₆-环烷基。

[0568] 术语“烷氧基”本身或与其他术语例如卤代烷氧基的组合应理解为是指O-烷基,其中术语“烷基”如上文所定义。

[0569] 卤素取代的基团(例如卤代烷基)为单卤代或多卤代的,最高达可能的取代基的最大数目。在多卤代的情况下,卤原子可以相同的或不同的。在这种情况下,卤素为氟、氯、溴或碘,特别是氟、氯或溴。

[0570] 除非另有说明,任取代的基团可以是单取代或多取代的,其中在多取代的情况下,取代基可以是相同的或不同的。

[0571] 上文在一般术语或在优选范围中给出的基团定义或说明适用于最终产物并且相应地适用于原料和中间体。这些基团定义可以根据需要彼此组合,即包括各自优选范围之间的组合。

[0572] 本发明优选使用式(I)的化合物,其含有上文列出的优选的含意的组合。

[0573] 本发明特别优选使用式(I)的化合物,其含有上文列出的特别优选的含意的组合。

[0574] 本发明非常特别优选使用式(I)的化合物,其含有上文列出的非常特别优选的定义的组合。

[0575] 本发明最优选使用式(I)的化合物,其含有上文列出的最优选的含意的组合。

[0576] 根据本发明,特别地使用式(I)的化合物,其中存在上文列出的特别优选的定义的组合。

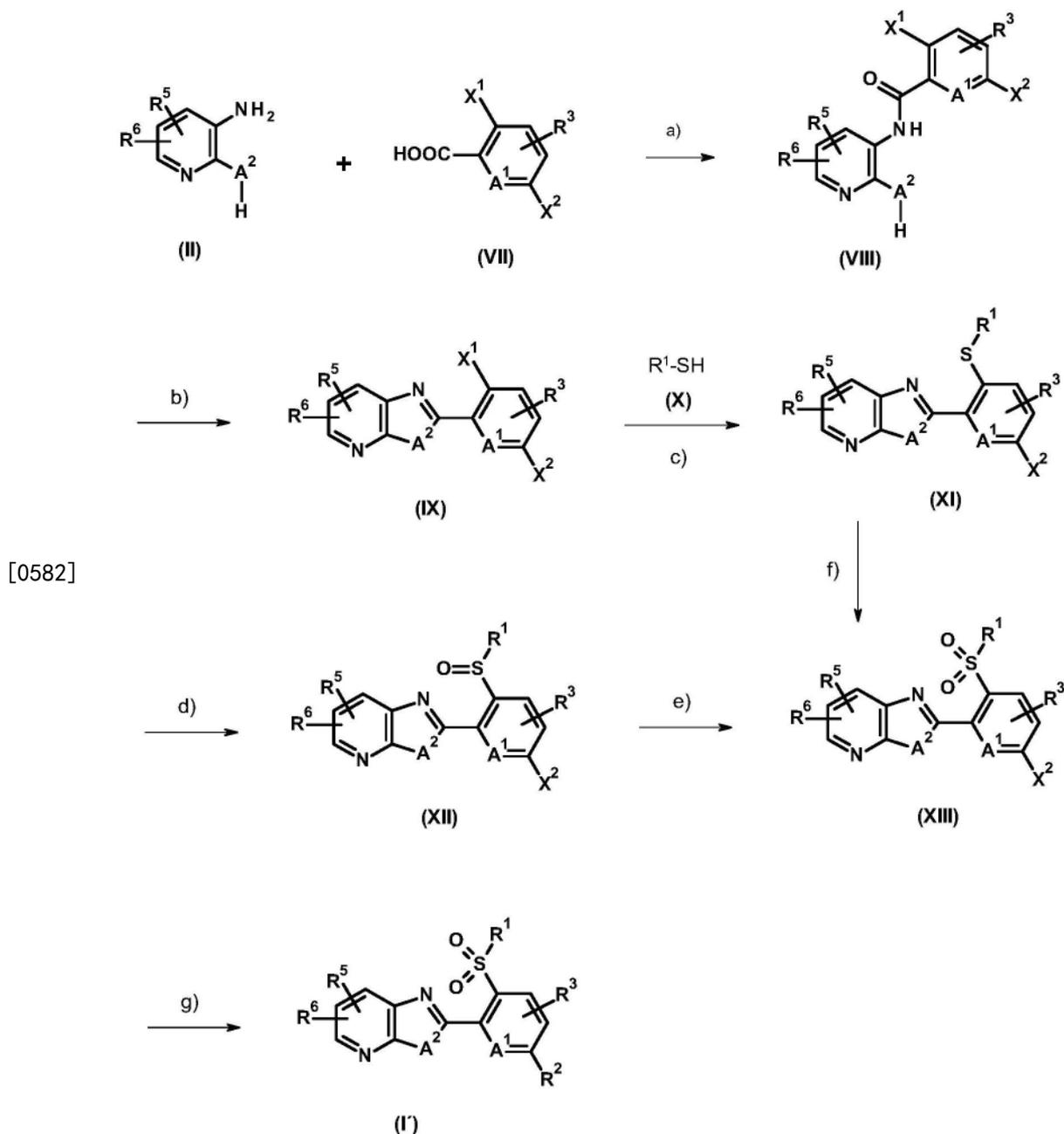
[0577] 根据取代基的性质,式(I)的化合物可为几何异构体和/或光学活性异构体或相应的具有不同组成的异构体混合物的形式。这些立体异构体为例如对映异构体、非对映异构体、阻转异构体或几何异构体。因此,本发明包括纯的立体异构体和这些异构体的任何混合物。

[0578] 本发明的式(I)的化合物可以通过以下方案中所示的方法获得:

[0579] 方法A

[0580] 其中X表示H1、H2、H4、H5、H6、H7、H8、H9、H14或H19的式(I)的化合物可以通过已知方法制备,例如类似于W02009/131237、W02010/125985、W02011/043404、W02011/040629、W02012/086848、W02013/018928或W02015/000715中所述的方法。

[0581] 制备其中X是H1、H2、H4、H5、H6、H7、H8、H9、H14或H19的式(I)的化合物的一般方法参考实施例H2、H5和H8描述于下文中。



[0583] 基团 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 和 A^1 具有上述含义, A^2 表示 $-N-R^7$ 、O或S,其中 R^7 具有上述含义并且 X^1 和 X^2 表示卤素。

[0584] 步骤a)

[0585] 式(VIII)的化合物可以类似于US5576335中所述的方法来制备,其通过将式(II)的化合物与式(VII)的羧酸在缩合剂或碱存在下反应来制备。

[0586] 式(II)的化合物可商购获得或可通过已知方法制备,例如类似于US2003/69257或W02006/65703中所述的方法。

[0587] 式(VII)的羧酸可商购获得或可通过已知方法制备,例如类似于US2010/234604、W02012/61926或Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters,18(2008),5023-5026中所述的方法。

[0588] 式(II)的化合物与式(VII)的羧酸的反应可以不用溶剂或在溶剂中进行,优选在

选自常规溶剂的溶剂中进行反应,所述常规溶剂在主要反应条件下呈惰性。优选醚类,例如二异丙基醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷;卤代烃类,例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯;腈类,例如乙腈或丙腈;芳族烃类,例如甲苯或二甲苯;非质子极性溶剂,例如N,N-二甲基甲酰胺或N-甲基吡咯烷酮,或含氮化合物,例如吡啶。

[0589] 合适的缩合剂为例如碳化二亚胺,例如1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳化二亚胺盐酸盐(EDCI)或1,3-二环己基碳化二亚胺。

[0590] 合适的碱是通常用于这类反应的无机碱。优选使用选自例如碱金属或碱土金属的乙酸盐、磷酸盐、碳酸盐和碳酸氢盐的碱。本文中,特别优选乙酸钠、磷酸钠、磷酸钾、碳酸铯、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠、碳酸氢钾。

[0591] 该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在0℃至180℃的温度下进行;其中优选地,反应在大气压和在20至140℃的温度下进行。

[0592] 步骤b)

[0593] 式(IX)的化合物可以通过将式(VIII)的化合物进行缩合来制备,例如类似于W02012/86848中所述的方法。

[0594] 至式(IX)的化合物的转化可以不用溶剂或在溶剂中进行,优选在选自常规溶剂的溶剂中进行反应,所述常规溶剂在主要反应条件下呈惰性。优选醚类,例如二异丙基醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、叔丁基甲基醚;卤代烃类,例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯;腈类,例如乙腈或丙腈;芳族烃类,例如甲苯或二甲苯;非质子极性溶剂,例如N,N-二甲基甲酰胺或N-甲基吡咯烷酮,或氮化合物,例如吡啶。

[0595] 该反应可以在缩合剂、酸、碱或氯化剂的存在下进行。

[0596] 合适的缩合剂的实例是碳化二亚胺,例如1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳化二亚胺盐酸盐(EDCI)或1,3-二环己基碳化二亚胺;酸酐,例如乙酸酐、三氟乙酸酐;三苯基膦、碱和四氯化碳的混合物,或三苯基膦和偶氮二酯(例如偶氮二羧酸二乙酯)的混合物。

[0597] 可用于所述反应的合适酸的实例为磺酸如对甲苯磺酸;羧酸如乙酸,或多磷酸。

[0598] 合适的碱的实例为氮杂环化合物,例如吡啶、甲基吡啶、2,6-二甲基吡啶、1,8-二氮杂双环[5.4.0]-7-十一碳烯(DBU);叔胺,例如三乙胺和N,N-二异丙基乙胺;无机碱,例如磷酸钾、碳酸钾和氢化钠。

[0599] 合适的氯化剂的实例为三氯氧化磷。

[0600] 该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在0℃至200℃的温度下进行。

[0601] 步骤c)

[0602] 式(XI)的化合物可以通过使式(IX)的化合物与式(X)的化合物在碱的存在下反应来制备。

[0603] 式(X)的硫醇衍生物,例如甲硫醇、乙硫醇或异丙硫醇可商购获得或者可以通过已知方法制备,例如类似于US2006/25633、US2006/111591、US2820062、Chemical Communications,13(2000),第1163-1164页或Journal of the American Chemical Society,44(1922),第1329页中所述的方法。

[0604] 至式(XI)的化合物的转化可以不用溶剂或在溶剂中进行,优选在选自常规溶剂的溶剂中进行反应,所述常规溶剂在主要反应条件下呈惰性。优选醚类,例如二异丙基醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、叔丁基甲基醚;腈类,例如乙腈或丙腈;芳族烃类,例如

甲苯或二甲苯;非质子极性溶剂,例如N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮或二甲基亚砷。

[0605] 合适的碱的实例是选自碱金属或碱土金属的乙酸盐、磷酸盐和碳酸盐的无机碱。在此优选碳酸铯、碳酸钠和碳酸钾。其他合适的碱是碱金属氢化物,例如氢化钠。

[0606] 反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在0℃至200℃的温度下进行。

[0607] 步骤d)

[0608] 式(II)的化合物可以通过氧化式(XI)的化合物来制备。氧化通常在选自常规溶剂的溶剂中进行,所述常规溶剂在主要反应条件下呈惰性。优选卤代烃类,例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯;醇类,例如甲醇或乙醇;甲酸、乙酸、丙酸或水。

[0609] 合适的氧化剂的实例是过氧化氢、间氯过氧苯甲酸或高碘酸钠。

[0610] 该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在-20℃至120℃的温度下进行。

[0611] 步骤e)

[0612] 式(XIII)的化合物可以通过氧化式(XII)的化合物来制备。氧化通常在溶剂中进行。优选卤代烃类,例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯;醇类,例如甲醇或乙醇;甲酸、乙酸、丙酸或水。

[0613] 合适的氧化剂的实例是过氧化氢和间氯过氧苯甲酸。

[0614] 该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在-20℃至120℃的温度下进行。

[0615] 步骤f)

[0616] 式(XIII)的化合物也可以以一步法通过氧化式(XI)的化合物来制备。氧化通常在溶剂中进行。优选卤代烃类,例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯;醇类,例如甲醇或乙醇;甲酸、乙酸、丙酸或水。

[0617] 合适的氧化剂的实例是过氧化氢和间氯过氧苯甲酸。

[0618] 反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在-20℃至120℃的温度下进行。

[0619] 步骤g)

[0620] 其中R²表示通过氮连接的环的式(I')化合物的制备可以通过文献中已知的方法进行(参见例如Journal of Organic Chemistry(2010),69,5578),例如,在碘化铜(I)和碱性反应助剂(例如反式-N,N'-二甲基环己烷-1,2-二胺和碳酸钾)的存在下,在合适的溶剂或稀释剂中进行。有用的溶剂或稀释剂包括所有惰性有机溶剂,例如脂族烃或芳族烃。优选使用甲苯。此外,偶联可以在合适的碱例如碳酸钾或碳酸铯存在下,在合适的溶剂或稀释剂中在没有金属催化下进行。有用的溶剂或稀释剂包括所有惰性有机溶剂,例如脂族烃或芳族烃。在此优选使用乙腈或二甲基甲酰胺。

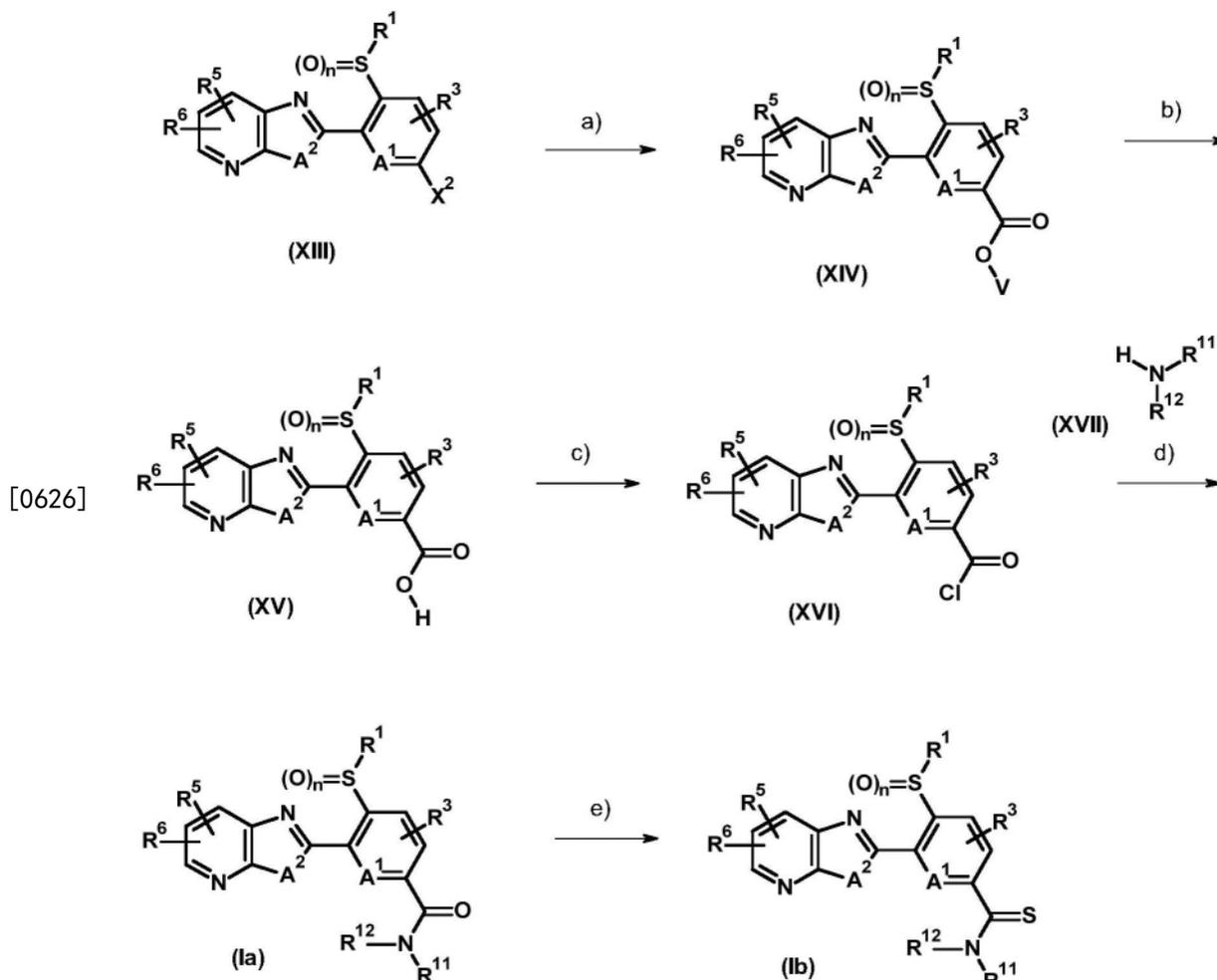
[0621] 其中R²表示通过碳连接的环的式(I)的化合物可以例如通过通常已知的方法由式(XIII)的化合物(其中X优选表示选自氯或溴的卤素)制备(参见Chem.Rev.1995,95,2457-2483;Tetrahedron 2002,58,9633-9695;Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions(编者:A.de Meijere,F.Diederich),第二版,Wiley-VCH,Weinheim,2004)。

[0622] 例如,其中X²优选表示氯或溴的式(XIII)的化合物可以在选自过渡金属盐的合适的催化剂存在下通过已知方法(参见W02010071819)与合适的芳基硼酸或其酯反应而得到式(I')的化合物。优选的偶联催化剂的实例包括钯催化剂,例如[1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁]二氯化钯(II)或四(三苯基膦)钯。用于进行该方法的合适的碱性反应助剂优选为钠或钾的碳酸盐。

[0623] 所需的某些(杂)芳基硼酸或(杂)芳基硼酸酯是已知的和/或可商购的,或者它们可以通过通常已知的方法制备(参见Boronic Acids(编者:D.G.Hall),第二版,Wiley-VCH, Weinheim,2011)。

[0624] 根据步骤g)的反应也可以由式(XI)或(XII)的化合物起始进行。

[0625] 方法B



[0627] 基团 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有上述含义, A^2 表示 $-N-R^7$ 、 O 或 S ,其中 R^7 具有上述含义, X^2 表示卤素,并且 V 表示 (C_1-C_4) 烷基。

[0628] 步骤a)

[0629] 其中 R^2 表示C连接的羧酰胺或硫代酰胺的式(Ia或Ib)的化合物可以例如类似于S.A.Vinogradov,D.F.Wilson,Tetrahedron Letters 39(1998),8935-8938,通过式(XIII)的化合物的羰基化来制备。基团 V 优选表示甲基、乙基、正丙基或正丁基。适用作用于反应的催化剂是钨络合物,例如氯化钨、三苯基膦和DPPP(1,3-双(二苯基膦)丙烷)(1:1:1)的催化剂。优选的碱为例如Hünig's碱(二异丙基乙胺)或DBU(1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯)。

[0630] 步骤b、c、d)

[0631] 式(XIV)的酯可以通过标准方法(参见DE 2221647)进行转化,首先转化为式(XV)的酸,例如在作为溶剂的醇(如乙醇)或四氢呋喃和水的混合物中,使用作为碱的碱金属氢氧化物(如氢氧化钠或氢氧化锂)。

[0632] 然后通过标准方法将式 (XV) 的酸转化为式 (XVI) 的酰氯, 例如使用氯化试剂, 如亚硫酸酰氯或草酰氯。

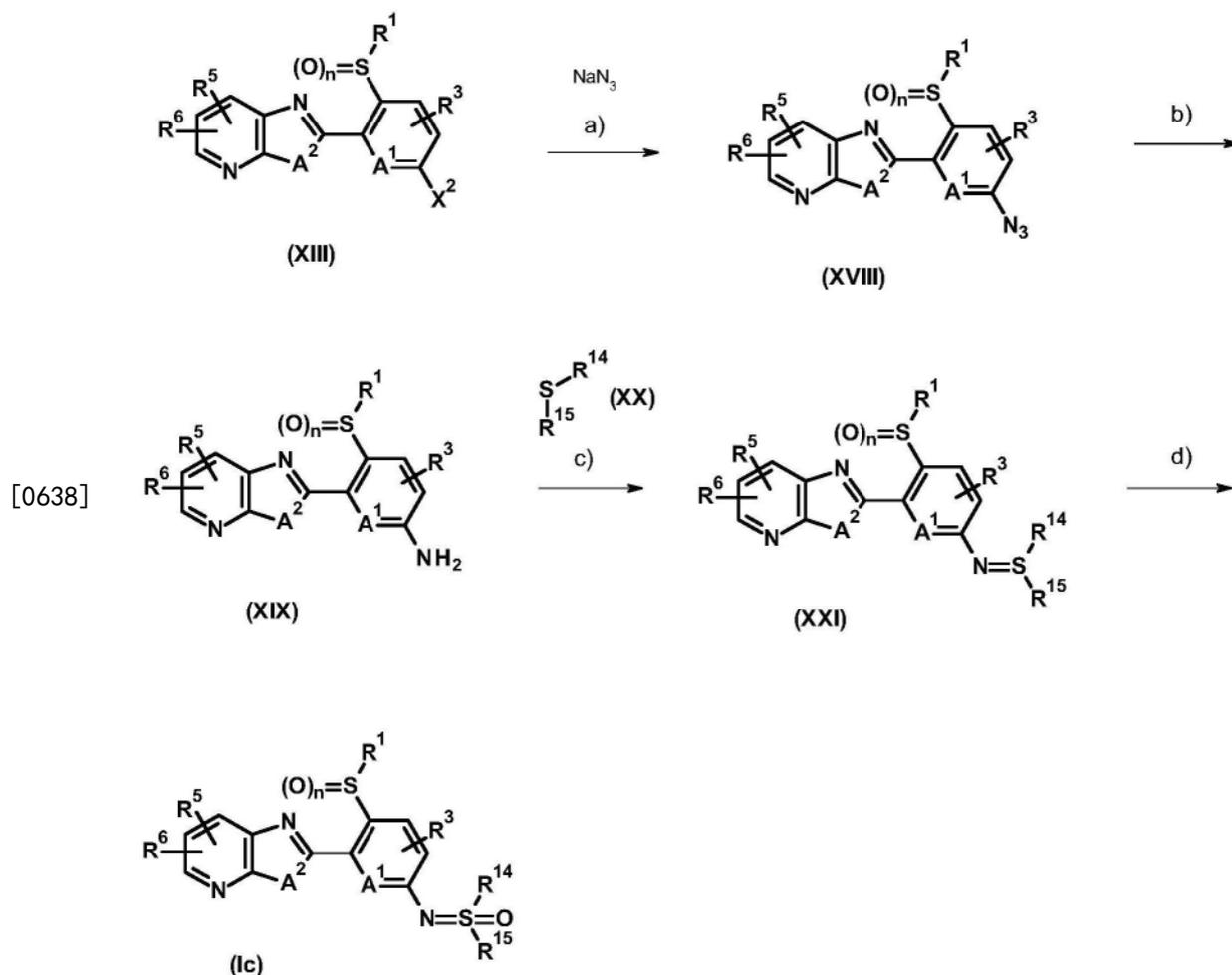
[0633] 在稀释剂 (例如二氯甲烷或四氢呋喃) 中, 并在碱 (例如三乙胺或二异丙基乙胺) 存在下与式 (XVII) 的胺进一步反应, 得到本发明式 (Ia) 的化合物 (对应于式 I (G3))。

[0634] 式 (XVII) 的化合物可商购获得或可通过已知方法制备。

[0635] 步骤e)

[0636] 式 (Ib) 的硫代酰胺 (对应于式 I (G4)) 可以由式 (Ia) 的甲酰胺通过与硫化剂例如劳森 (Lawesson) 试剂或 P_4S_{10} 反应来制备。

[0637] 方法C



[0639] 基团 $R^1, R^3, R^5, R^6, R^{14}, R^{15}, A^1$ 和 n 具有上述含义, A^2 表示 $-N-R^7, O$ 或 S , 其中 R^7 具有上述含义, X^2 表示卤素。

[0640] 步骤a)

[0641] 式 (XVIII) 的化合物可以类似于 W02015/002211 的方法通过使式 (XIII) 的化合物与叠氮化钠反应来制备。

[0642] 至式 (XVIII) 的化合物的转化通常在溶剂中进行, 优选在选自常规溶剂的溶剂中进行反应, 所述常规溶剂在主要反应条件下呈惰性。优选醚类, 例如四氢呋喃、乙二醇二甲醚、二噁烷, 非质子极性溶剂, 例如 N, N -二甲基甲酰胺、 N -甲基吡咯烷酮、二甲基亚砷, 或醇类, 例如甲醇或乙醇。

[0643] 步骤b)

[0644] 式 (XIX) 的化合物可以通过例如类似于W02015/002211中所述的方法还原式 (XVIII) 的中间体来制备。

[0645] 合适的还原剂的实例为三苯基膦、三丁基膦、氯化锡 (III) 和锌。

[0646] 至式 (XIX) 的化合物的转化通常在溶剂中进行。优选醚类如四氢呋喃、乙二醇二甲醚、二噁烷, 脂族烃类如己烷、庚烷, 芳族烃类如甲苯、二甲苯, 卤代烃类如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯, 非质子极性溶剂如N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、二甲基亚砜, 或醇类如甲醇或乙醇。

[0647] 如果需要的话, 可以将酸如盐酸或乙酸添加到反应中。

[0648] 步骤c)

[0649] 式 (XXI) 的化合物 (式I (G16), 其中 $p=0$) 可以通过使式 (XIX) 的化合物与式 (XX) 的化合物在氧化剂存在下进行反应来制备。

[0650] 式 (XX) 的化合物可商购获得或可通过已知方法制备。

[0651] 至式 (XXI) 的化合物的转化通常在溶剂中进行。优选醚类如四氢呋喃、甲基叔丁基醚、二噁烷; 脂族烃类如己烷、庚烷; 芳族烃类如甲苯、二甲苯; 卤代烃类如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯; 非质子极性溶剂如N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、二甲基亚砜; 或醇类如甲醇或乙醇。

[0652] 氧化剂的实例为卤化剂, 例如N-氯代琥珀酰亚胺或高价碘化合物如双(乙酸基-0)苯基碘。

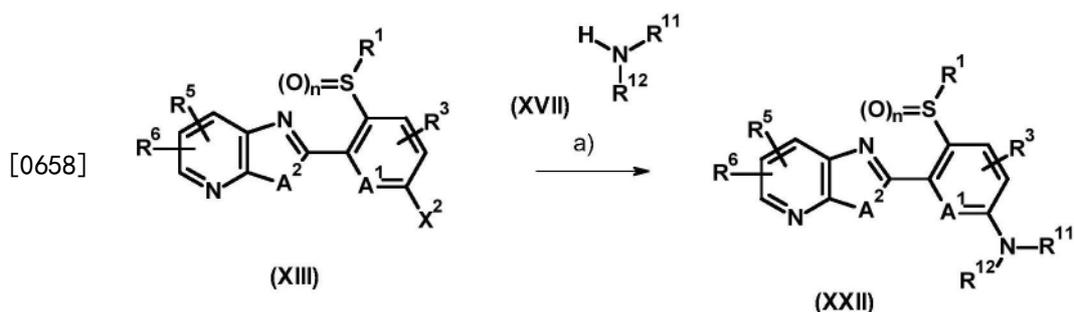
[0653] 步骤d)

[0654] 式 (Ic) 的化合物 (对应于其中 $p=1$ 的式I (G16)) 可以类似于W02015/002211中所述的方法通过使式 (XXI) 的化合物与氧化剂进行反应来制备。

[0655] 合适的氧化剂的实例为高碘酸钠和间氯过氧苯甲酸。

[0656] 用于氧化的合适的溶剂例如为卤代脂族烃类如二氯甲烷或氯仿, 醇如甲醇或乙醇, 以及乙酸。

[0657] 方法D



[0659] 基团 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有上述含义, A^2 表示-N- R^7 、O或S, 其中 R^7 具有上述含义, X^2 表示卤素。

[0660] 步骤a)

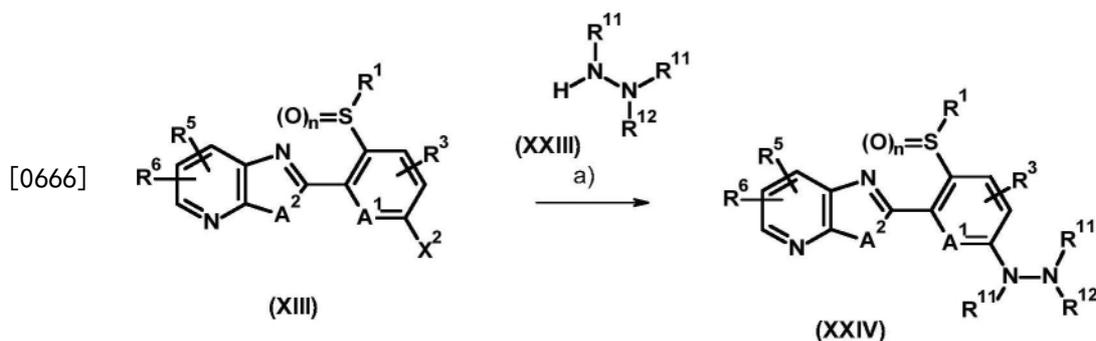
[0661] 式 (XXII) 的化合物 (对应于式I (G10)) 可以类似于W02015/002211的方法通过使式 (XIII) 的化合物与式 (XVII) 的化合物进行反应来制备。

[0662] 式 (XVII) 的化合物可商购获得或可通过已知方法制备。

[0663] 至式 (XXII) 的化合物的转化通常在溶剂中进行。优选醚类如四氢呋喃、甲基叔丁基醚、二噁烷、乙二醇二甲醚；脂族烃类如己烷、庚烷；芳族烃类如甲苯、二甲苯；卤代烃类如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯；非质子极性溶剂例如N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、二甲基亚砜；或酯类例如乙酸乙酯，或腈类如乙腈。

[0664] 反应可以在碱的存在下进行。合适的碱的实例是氮杂环化合物如吡啶、甲基吡啶、2,6-二甲基吡啶、1,8-二氮杂双环[5.4.0]-7-十一碳烯 (DBU)；叔胺如三乙胺和N,N-二异丙基乙胺；或无机碱如磷酸钾、碳酸钾和氢化钠。

[0665] 方法E



[0667] 基团 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有上述含义， A^2 表示-N- R^7 、O或S，其中 R^7 具有上述含义， X^2 表示卤素。

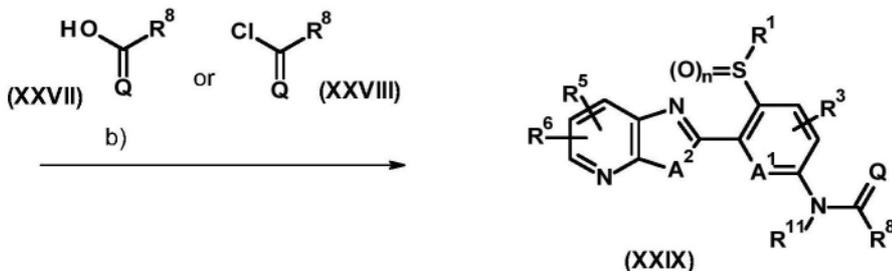
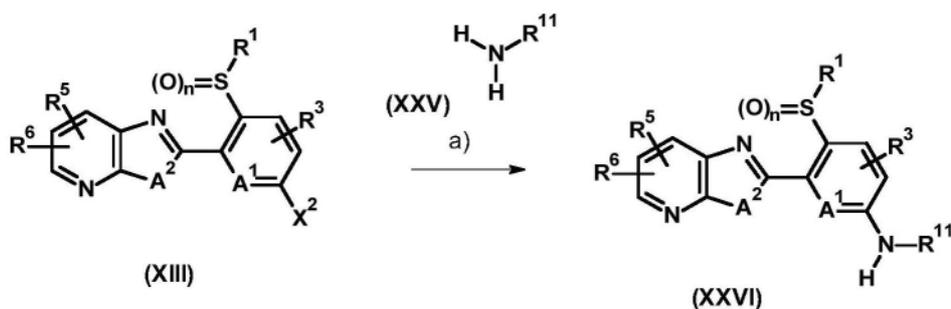
[0668] 步骤a)

[0669] 式 (XXIV) 的化合物 (对应于式I (G11)) 可通过使式 (XIII) 的化合物与式 (XXIII) 的化合物进行反应来制备。

[0670] 式 (XXIII) 的化合物可商购获得或可通过已知方法制备。

[0671] 反应在类似于方法D中所述的反应条件下进行。

[0672] 方法F



[0674] 基团 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 A^1 和 n 具有上述含义， A^2 表示-N- R^7 、O或S，其中 R^7 具有上述

含义, X^2 表示卤素且Q表示O或S。

[0675] 步骤a)

[0676] 式 (XXVI) 的化合物可通过使式 (XIII) 的化合物与式 (XXV) 的化合物进行反应来制备。

[0677] 式 (XXV) 的化合物可商购获得或者可以通过已知方法制备。

[0678] 反应在类似于方法D中所述的反应条件下进行。

[0679] 步骤b)

[0680] 式 (XXIX) 的化合物 (对应于其中Q=O的式I (G12) 和其中Q=S的I (G13)) 可以通过使式 (XXVI) 的化合物与式 (XXVII) 的化合物进行反应来制备。

[0681] 式 (XXVII) 的化合物可商购获得或可通过已知方法制备。

[0682] 至式 (XXIX) 的化合物的转化通常在溶剂中进行。优选醚类如四氢呋喃、甲基叔丁基醚、二噁烷、乙二醇二甲基醚; 卤代烃类如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯; 芳族烃类如甲苯、二甲苯; 酯类如乙酸乙酯; 腈类如乙腈; 非质子极性溶剂如N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、二甲基亚砜; 或含氮杂环化合物如吡啶或喹啉。

[0683] 该反应可以在缩合剂的存在下进行。合适的缩合剂的实例为碳化二亚胺, 例如1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳化二亚胺盐酸盐 (EDCI) 和1,3-二环己基碳化二亚胺。

[0684] 该反应可以在合适的催化剂的存在下进行。合适的催化剂的实例为1-羟基苯并三唑。

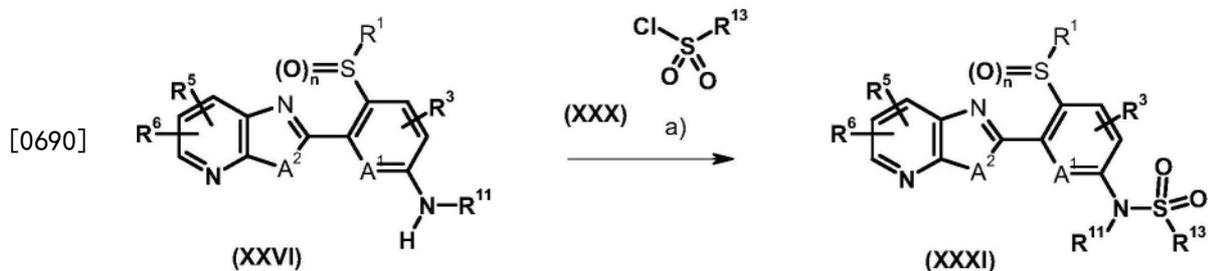
[0685] 式 (XXIX) 的化合物还可以通过使式 (XXVI) 的化合物与式 (XXVIII) 的化合物进行反应来制备。

[0686] 式 (XXVIII) 的化合物可商购获得或可以通过已知方法制备。

[0687] 至式 (XXIX) 的化合物的转化通常在溶剂中进行。优选醚类如四氢呋喃、甲基叔丁基醚、二噁烷、乙二醇二甲基醚; 脂族烃类如己烷、庚烷; 芳族烃类如甲苯、二甲苯; 卤代烃类如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯; 非质子极性溶剂如N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、二甲基亚砜; 或酯类如乙酸乙酯; 或腈类如乙腈。

[0688] 反应可以在碱的存在下进行。合适的碱的实例为氮杂环化合物如吡啶、二甲基氨基吡啶、甲基吡啶、2,6-二甲基吡啶、1,8-二氮杂双环[5.4.0]-7-十一碳烯 (DBU); 叔胺如三乙胺和N,N-二异丙基乙胺; 或无机碱如碳酸钾和氢氧化钠。

[0689] 方法G



[0691] 基团 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^{11} 、 R^{13} 、 A^1 和 n 具有上述含义, A^2 表示 $-N-R^7$ 、O 或 S, 其中 R^7 具有上述含义。

[0692] 步骤a)

[0693] 式 (XXXI) 的化合物 (对应于式I (G14)) 可以通过使式 (XXVI) 的化合物与式 (XXX) 的

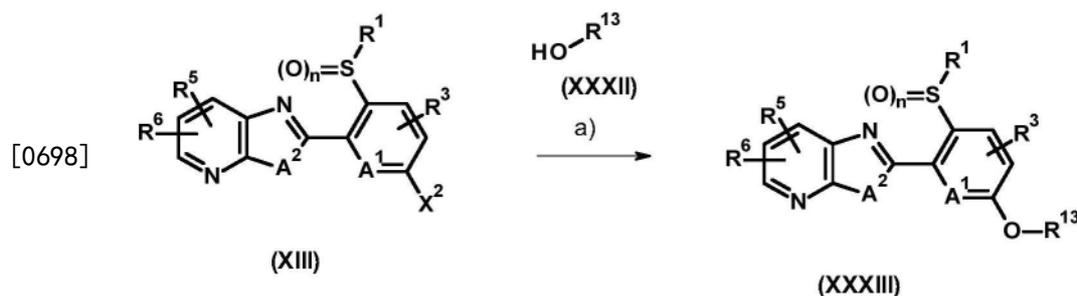
化合物进行反应来制备。

[0694] 式 (XXX) 的化合物可商购获得或者可以通过已知方法制备。

[0695] 至式 (XXXI) 的化合物的转化通常在溶剂中进行。优选醚类如四氢呋喃、甲基叔丁基醚、二噁烷、乙二醇二甲基醚；脂族烃类如己烷、庚烷；芳族烃类如甲苯、二甲苯；卤代烃类如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯；酯类如乙酸乙酯；腈类如乙腈；或非质子极性溶剂如N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、二甲基亚砜。

[0696] 该反应可以在碱的存在下进行。合适的碱的实例为氮杂环化合物如吡啶、二甲基氨基吡啶、甲基吡啶、2,6-二甲基吡啶、1,8-二氮杂双环[5.4.0]-7-十一碳烯 (DBU)；叔胺如三乙胺和N,N-二异丙基乙胺；或无机碱如碳酸钾和氢化钠。

[0697] 方法H



[0699] 基团 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^{13} 、 R^1 、 A^1 和 n 具有上述含义， A^2 表示-N- R^7 、O或S，其中 R^7 具有上述含义且 X^2 表示卤素。

[0700] 步骤a)

[0701] 式 (XXXIII) 的化合物 (对应于式I (G17)) 可以通过例如类似于方US4558134或US2014/275026中所述的方法使式 (XIII) 的化合物与式 (XXXII) 的化合物进行反应来制备。

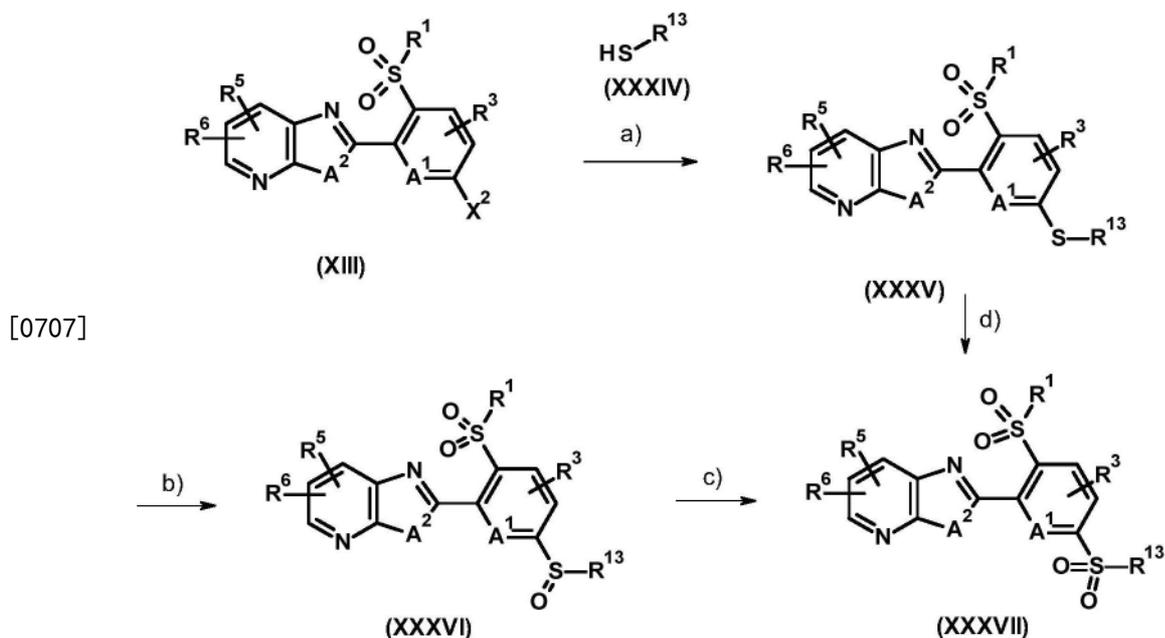
[0702] 式 (XXXII) 的化合物可商购获得或可通过已知方法制备。

[0703] 至式 (XXXIII) 的化合物的转化可以不用溶剂或在溶剂中进行，优选在选自常规溶剂的溶剂中进行反应，所述常规溶剂在主要反应条件下呈惰性。优选醚类，例如二异丙基醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、叔丁基甲基醚；腈类，例如乙腈或丙腈；芳族烃类，例如甲苯或二甲苯；非质子极性溶剂，例如N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮或二甲基亚砜。

[0704] 合适的碱的实例是选自碱金属或碱土金属的乙酸盐、磷酸盐和碳酸盐的无机碱。在此优选碳酸铯、碳酸钠、碳酸钾和叔丁醇钾。其他合适的碱是碱金属氢化物，例如氢化钠。

[0705] 该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在 0°C 至 200°C 的温度下进行。

[0706] 方法I



[0707]

[0708] 基团 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^{13} 和 A^1 具有上述含义， A^2 表示-N- R^7 、O或S，其中 R^7 具有上述含义且 X^2 表示卤素。

[0709] 步骤a)

[0710] 式(XXXV)的化合物(对应于其中 $m=0$ 的式I(G5))可以通过使式(XIII)的化合物与式(XXXIV)的化合物进行反应来制备。

[0711] 式(XXXIV)的化合物可商购获得或者可以通过已知方法制备。

[0712] 至式(XXXV)的化合物的转化可以不用溶剂或在溶剂中进行，优选在选自常规溶剂的溶剂中进行反应，所述常规溶剂在主要反应条件下呈惰性。优选醚类，例如二异丙基醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、叔丁基甲基醚；腈类，例如乙腈或丙腈；芳族烃类，例如甲苯或二甲苯；非质子极性溶剂，例如N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮或二甲基亚砷。

[0713] 合适的碱的实例是选自碱金属或碱土金属的乙酸盐、磷酸盐和碳酸盐的无机碱。在此优选碳酸铯、碳酸钠、碳酸钾和叔丁醇钾。其他合适的碱是碱金属氢化物，例如氢化钠。

[0714] 该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在 0°C 至 200°C 的温度下进行。

[0715] 步骤b)

[0716] 式(XXXVI)的化合物(对应于其中 $m=1$ 的式I(G5))可以通过氧化式(XXXV)的化合物来制备。氧化通常在选自常规溶剂的溶剂中进行，所述常规溶剂在主要反应条件下呈惰性。优选卤代烃类如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯；醇类如甲醇或乙醇；甲酸、乙酸、丙酸或水。

[0717] 合适的氧化剂的实例为过氧化氢、间氯过氧苯甲酸或高碘酸钠。

[0718] 该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在 -20°C 至 120°C 的温度下进行。

[0719] 步骤c)

[0720] 式(XXXVII)的化合物(对应于其中 $m=2$ 的式I(G5))可通过氧化式(XXXVI)的化合物来制备。氧化通常在溶剂中进行。优选卤代烃类，例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯；醇类，例如甲醇或乙醇；甲酸、乙酸、丙酸或水。

[0721] 合适的氧化剂的实例是过氧化氢和间氯过氧苯甲酸。

[0722] 该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在-20℃至120℃的温度下进行。

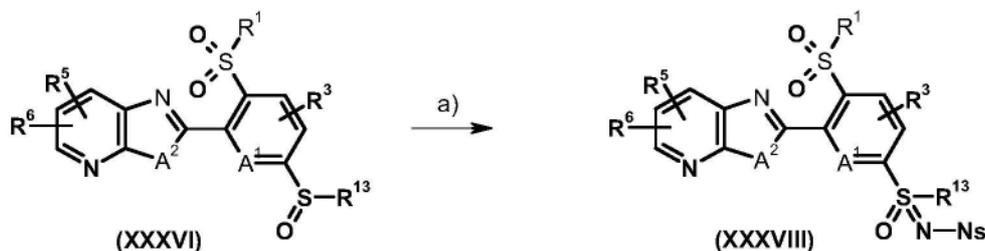
[0723] 步骤d)

[0724] 式(XXXVII)的化合物(对应于其中m=2的式I(G5))也可以以一步法通过氧化式(XXXV)的化合物来制备。氧化通常在溶剂中进行。优选卤代烃类,例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯;醇类,如甲醇或乙醇;甲酸、乙酸、丙酸或水。

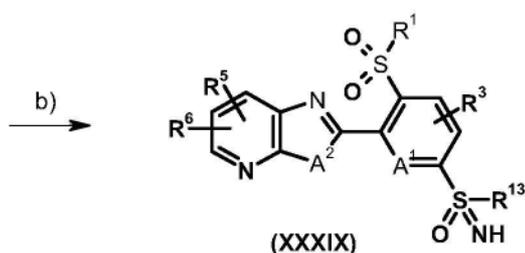
[0725] 合适的氧化剂的实例为过氧化氢和间氯过氧苯甲酸。

[0726] 该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在-20℃至120℃的温度下进行。

[0727] 方法J



[0728]



[0729] 基团 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^{13} 和 $A1$ 具有上述含义, A^2 表示-N- R^7 、O或S,其中 R^7 具有上述含义。 Ns =硝基磺酰基(nosyl)/4-硝基苄基磺酰基。

[0730] 步骤a)

[0731] 式(XXXVIII)的化合物可以通过用4-硝基苄基磺酰胺($NsNH_2$)和具有金属催化作用的高价碘化合物将式(XXXVI)的化合物亚胺化来制备,例如类似于Organic Letters 2006,8,2349和Chemistry-A European Journal 2007,13,6674中所述的方法。

[0732] 至式(XXXVIII)的化合物的转化优选在选自常规溶剂的溶剂中进行,所述常规溶剂在主要反应条件下呈惰性。优选腈类,例如乙腈,或者优选卤代烷类例如二氯甲烷。

[0733] 金属催化剂的实例为铁、铜、银或铈化合物,例如乙酰丙酮铁(II)、乙酰丙酮铁(III)和乙酸铈(II)。二乙酰氧基碘代苯或亚碘酰苯经常用作高价碘化合物。

[0734] 反应可在减压下、在大气压下或在高压下和在室温下进行。

[0735] 步骤b)

[0736] 式(XXXIX)的化合物(对应于式I(G6))可以由式(XXXVII)的化合物通过在碱性条件下与硫醇反应来制备,例如类似于Organic Letters 2006,8,2349;Chemistry-A European Journal 2007,13,6674和W02006/101860中所述的方法。

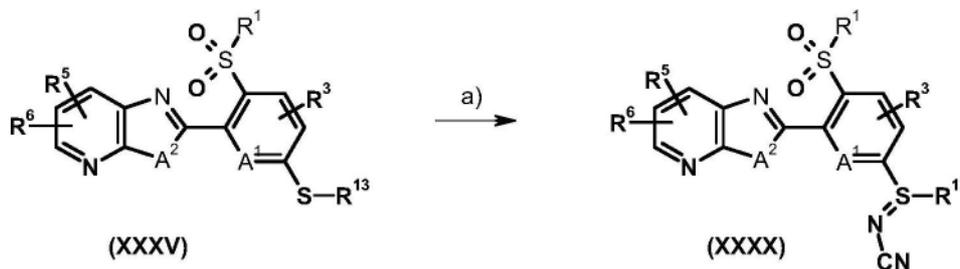
[0737] 至式(XXXIX)的化合物的转化通常在溶剂中进行。优选醚类如四氢呋喃,或腈类如乙腈。

[0738] 所用的硫醇例如为苯硫酚与无机碱的组合,所述无机碱选自碱金属或碱土金属的

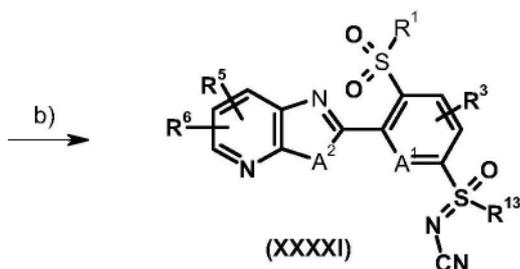
碳酸盐,例如碳酸铯。还记载了使用甲硫醇钠的甲醇溶液。

[0739] 该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在 -78°C 至 30°C 的温度下进行。

[0740] 方法K



[0741]



[0742] 基团 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^{13} 和 A^1 具有上述含义, A^2 表示 $-\text{N}-\text{R}^7$ 、 O 或 S ,其中 R^7 具有上述含义。

[0743] 步骤a)

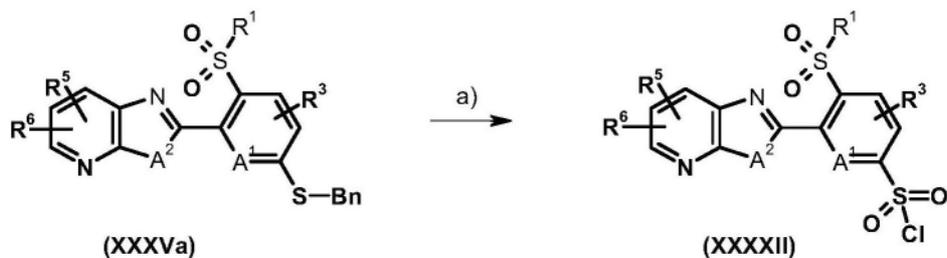
[0744] 式(XXXX)的化合物(对应于式I(G8))可以由式(XXXV)的化合物在高价碘化合物存在下通过使用氰胺进行亚胺化来制备,例如类似于Organic Letters 2007,9,2951中所述的方法。至式(XXXX)的化合物的转化通常在作为溶剂的乙腈中进行。二乙酰氧基碘代苯和亚碘酰苯经常用作高价碘化合物。该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在 0°C 至 30°C 的温度下进行。

[0745] 式(XXXX)的化合物还可以由式(XXXV)的化合物在碱性条件下在N-溴琥珀酰亚胺(NBS)或碘的存在下,通过使用氰胺进行亚胺化来制备,例如类似于Organic Letters 2007,9,3809或W02014/29830中所述的方法。在该情况下,至式(XXXX)的化合物的转化在溶剂中进行。优选使用醇类如甲醇,醚类如四氢呋喃,或腈类如乙腈。合适的碱的实例为醇盐,例如叔丁醇钾。其他合适的碱为碱金属氢化物,例如氢化钠。该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在室温下进行。

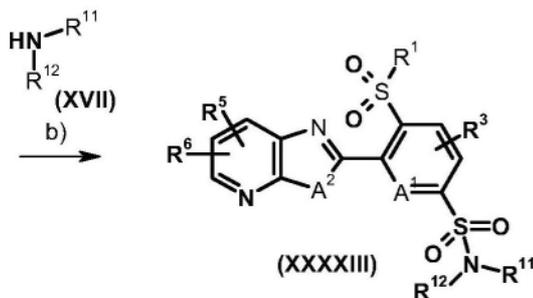
[0746] 步骤b)

[0747] 式(XXXXI)的化合物(对应于式I(G7))可以由式(XXXX)的化合物在碱性条件下通过氧化来制备,例如类似于Organic Letters 2007,9,2951;Organic Letters 2007,9,3809或W02014/140075所述的方法。氧化通常在溶剂中进行。优选醇类,例如乙醇。所使用的氧化剂为例如间氯过氧苯甲酸。合适的碱的实例为碳酸盐,例如碳酸钾。该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在 0°C 至 30°C 的温度下进行。

[0748] 方法L



[0749]



[0750] 基团 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^{11} 、 R^{12} 和 A^1 具有上述含义， A^2 表示 $-N-R^7$ 、 O 或 S ，其中 R^7 具有上述含义。Bn=苄基/ CH_2Ph 。

[0751] 步骤a)

[0752] 式(XXXII)的化合物可以由式(XXXVa)的中间体在氯源存在下通过氧化来制备，例如类似于W02008/2244和W02010/24451中所述的方法。

[0753] 至式(XXXII)的化合物的转化通常在溶剂中进行。优选卤代烷烃类，例如二氯甲烷或四氯甲烷。通常使用与水的混合物。

[0754] 所使用的氯源和氧化剂是例如氯气或N-氯代琥珀酰亚胺。

[0755] 通常，反应在酸性介质中进行。所用的酸为例如羧酸类，如甲酸或乙酸。

[0756] 反应可在减压下、在大气压下或在高压下和在 $0^\circ C$ 至 $30^\circ C$ 的温度下进行。

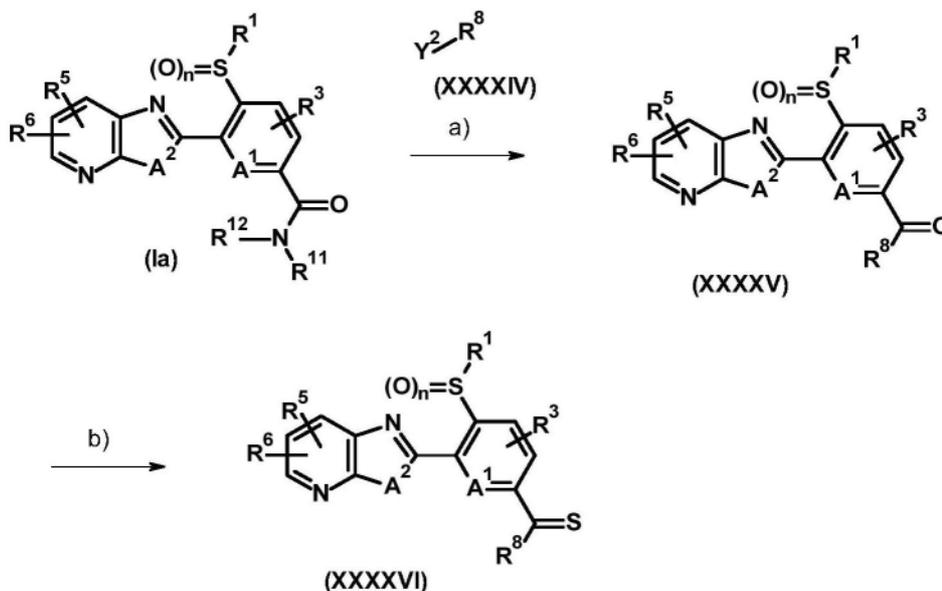
[0757] 步骤b)

[0758] 式(XXXIII)的化合物(对应于式I(G9))可以由式(XXXII)的化合物与式(XVII)的化合物在标准条件下制备。

[0759] 至式(XXXIII)的化合物的转化通常在溶剂中进行。优选醚类，例如四氢呋喃、甲基叔丁基醚、二噁烷、乙二醇二甲基醚；脂族烃类，例如己烷、庚烷；芳族烃类，例如甲苯、二甲苯；卤代烃类，例如，二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯；酯类，例如乙酸乙酯；腈类，例如乙腈；或非质子极性溶剂，例如N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、二甲基亚砜。

[0760] 该反应可以在碱的存在下进行。合适的碱的实例是氮杂环化合物如吡啶、二甲基氨基吡啶、甲基吡啶、2,6-二甲基吡啶、1,8-二氮杂双环[5.4.0]-7-十一碳烯(DBU)；叔胺如三乙胺和N,N-二异丙基乙胺；或无机碱如碳酸钾和氢氧化钠。

[0761] 方法M



[0762]

[0763] 基团R¹、R³、R⁵、R⁶、R⁸、R¹¹、R¹²、A¹和In具有上述含义，A²表示-N-R⁷、O或S，其中R⁷具有上述含义。Y²表示Cl、Br或I。

[0764] 步骤a)

[0765] 式(XXXV)的化合物(对应于式I(G1))可以通过将式(XXXIV)的化合物转化为有机金属化合物并随后与式(Ia)的化合物反应来制备，例如类似于US5821246和European Journal of Medicinal Chemistry 2012,58,第396页中所述的方法。

[0766] 式(XXXIV)的化合物可商购获得或可通过已知方法制备。

[0767] 有机金属化合物可以例如由式(XXXIV)的化合物通过与镁或烷基锂化合物进行反应来制备。

[0768] 至式(XXXV)的化合物的转化通常在溶剂中进行。优选醚类，例如四氢呋喃或乙醚。

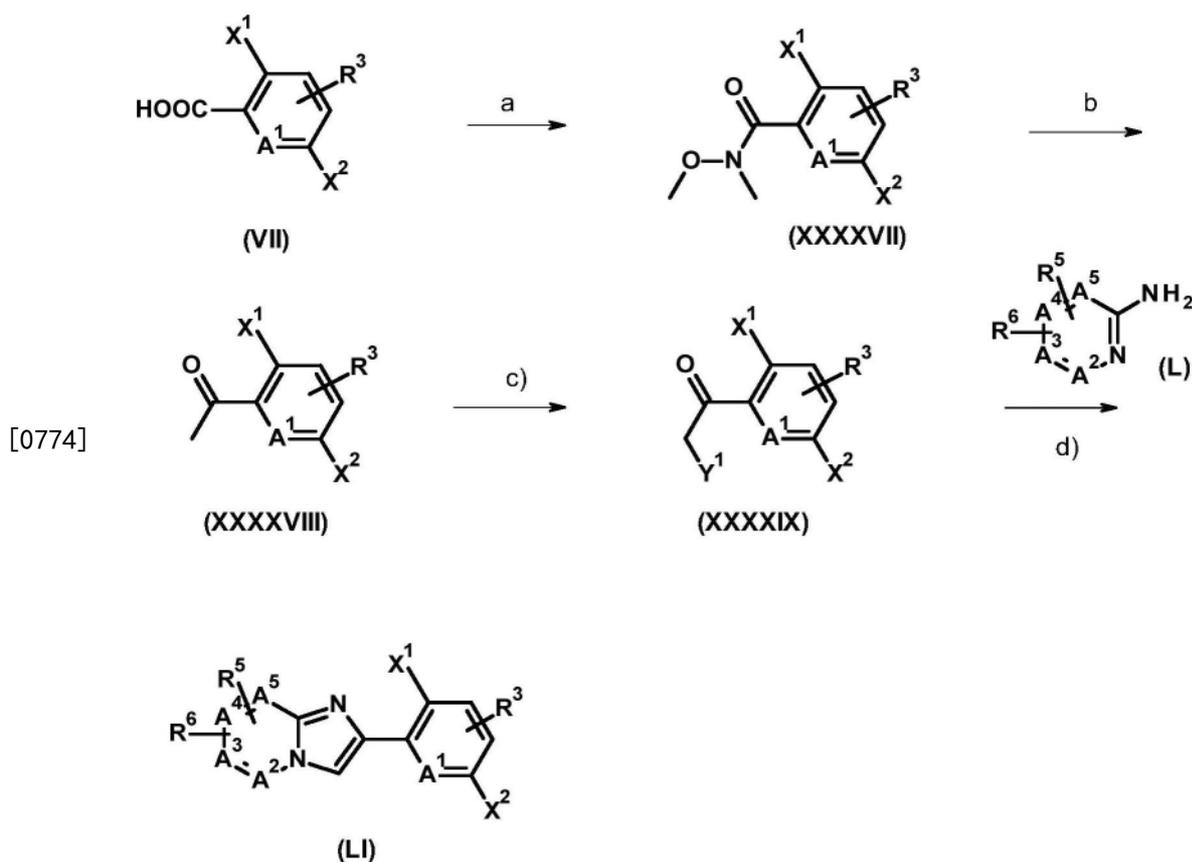
[0769] 反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在-78℃至45℃的温度下进行。

[0770] 步骤b)

[0771] 式(XXXVI)的硫酮(对应于式I(G2))可以由式(XXXV)的化合物通过与硫化剂如劳森(Lawesson)试剂或P₄S₁₀进行反应来制备。

[0772] 方法N

[0773] 其中X表示H10、H11、H15或H16的式(I)的化合物可通过已知方法制备，例如类似于US2009/203705、US2012/258951、W02013/3298或J. Med. Chem. 31, (1988) 1590-1595中所述的方法。



[0775] 基团 A^1 、 R^3 、 R^5 和 R^6 具有上述含义。 X^1 、 X^2 和 Y^1 表示卤素。 A^2 、 A^3 、 A^4 和 A^5 彼此独立地表示CH或N(其中 A^2 、 A^3 、 A^4 和 A^5 不同时表示N)。

[0776] 步骤a)

[0777] 以类似于W02011/75643或EP2671582中所述的方法,将式(VII)的羧酸在O,N-二甲基羟胺盐酸盐的存在下转化为式(XXXXVII)的Weinreb酰胺。

[0778] 式(VII)的羧酸可商购获得或可通过已知方法制备,例如类似于US2010/234604、W02012/61926或Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters,18(2008),5023-5026中所述的方法。

[0779] 步骤b、c)

[0780] 然后通过已知方法,例如以类似于W02011/75643中所述的方法,使用格氏试剂(例如甲基溴化镁)将式(XXXXVII)的化合物转化为式(XXXXVIII)的酮。式(XXXXIX)的化合物可以类似于例如US2012/302573中所述的已知方法通过随后的卤化来获得。

[0781] 步骤d)

[0782] 式(LI)的化合物可以通过使用式(L)的胺将式(XXXXIX)的化合物进行环化来制备。环化根据已知方法,类似于例如,W02005/66177、W02012/88411、W02013/3298、US2009/203705、US2012/258951、W02012/168733、W02014/187762或J.Med.Chem.31(1988)1590-1595中所述的方法,在乙醇、乙腈或N,N-二甲基甲酰胺中进行。

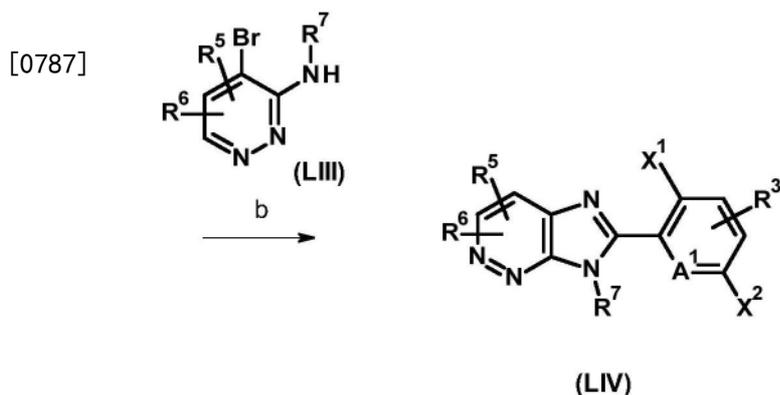
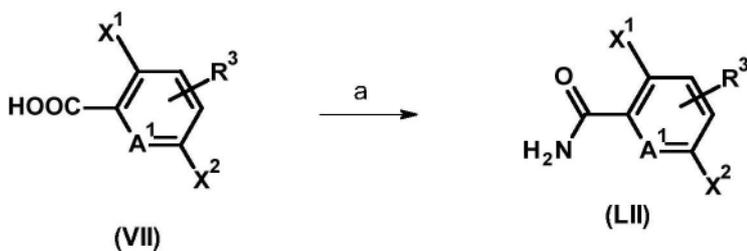
[0783] 式(L)的化合物可商购获得。

[0784] 式(LI)的化合物进一步转化为式(I)的化合物以类似于方法A至M、Q、R、T和U进行。

[0785] 方法0

[0786] 其中X表示H17的式(I)的化合物可通过已知方法制备,例如类似于W02014/142292

中所述的方法。



[0788] 基团 R^3 、 R^5 、 R^6 和 R^7 具有上述含义。 X^1 和 X^2 表示卤素。

[0789] 步骤a)

[0790] 式(LII)的化合物可以类似于US5374646或Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 2003,13,1093-1096中所述的方法通过使式(VII)的化合物与氨源在缩合剂存在下进行反应来制备。其中 $R^6=H$ 且 $R^5=$ 三氟甲基的式(LIII)的化合物的制备记载于W02016/039441中。

[0791] 式(VII)的羧酸可商购获得或可通过已知方法制备,例如类似于US2010/234604、W02012/61926或Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters,18(2008),5023-5026中所述的方法。

[0792] 式(VII)的化合物与氨源的反应优选在选自常规溶剂的溶剂中进行,所述常规溶剂在主要反应条件下呈惰性。优选醚类,例如二噁烷或四氢呋喃。

[0793] 合适的缩合剂是例如羰基二咪唑。

[0794] 反应可以在减压下、在大气压下或在高压下进行。优选地,该反应在大气压和20至70°C的温度下进行。

[0795] 步骤b)

[0796] 式(LIV)的化合物可以类似于W02014/142292中所述的方法通过使式(LII)的化合物与式(LIII)的化合物在钪催化剂存在下在碱性介质中进行反应来制备。

[0797] 式(LIII)的化合物可以例如类似于W02014/142292中所述的方法进行制备。适合的钪催化剂为例如[1,1'-双(二苯基膦)二茂铁]二氯化钪(II)。通常,使用的碱是无机碱,例如叔丁醇钾。

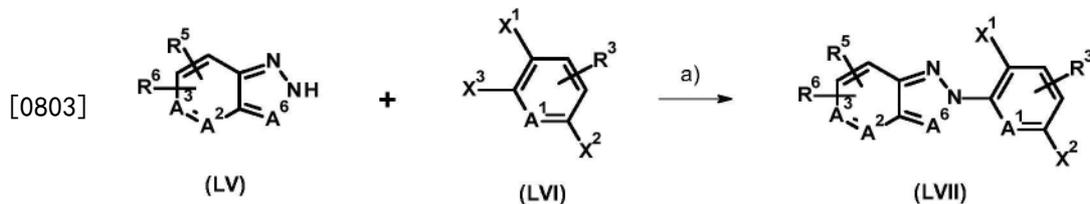
[0798] 反应在溶剂中进行。通常使用甲苯。

[0799] 该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下进行。优选地,该反应在大气压和20至110°C的温度下进行。

[0800] 式 (LIV) 的化合物向式 (I) 的化合物的进一步转化类似于方法A至M、Q、R、T和U进行。

[0801] 方法P

[0802] 其中X表示H3、H12、H13或H18的式 (I) 的化合物可通过已知方法制备,例如类似于W02010/091310、W0 2012/66061或W02013/099041中所述的方法。



[0804] 基团A¹、R³、R⁵和R⁶具有上述含义。A²、A³和A⁶彼此独立地表示CH或N(其中A²和A³不能同时表示N)。X¹、X²和X³表示卤素。

[0805] 步骤a)

[0806] 式 (LVII) 的化合物可通过使式 (LV) 的化合物与式 (LVI) 的化合物在碱性条件下进行反应来制备,例如类似于W02010/091310、W02012/66061或W02013/099041中所述的方法。

[0807] 式 (LV) 的化合物可商购获得或可通过已知方法制备,例如类似于W02005/100353、W02012/66061或European Journal of Medicinal Chemistry 2010,45,2214-2222中所述的方法。

[0808] 式 (LVI) 的化合物可商购获得或可通过已知方法制备,例如类似于W02013/43518、EP2168965或Journal of Medicinal Chemistry 2003,46,1449-1455中所述的方法。

[0809] 在大多数情况下,使用的碱是无机碱,例如氢氧化钠、碳酸钾或碳酸铯。

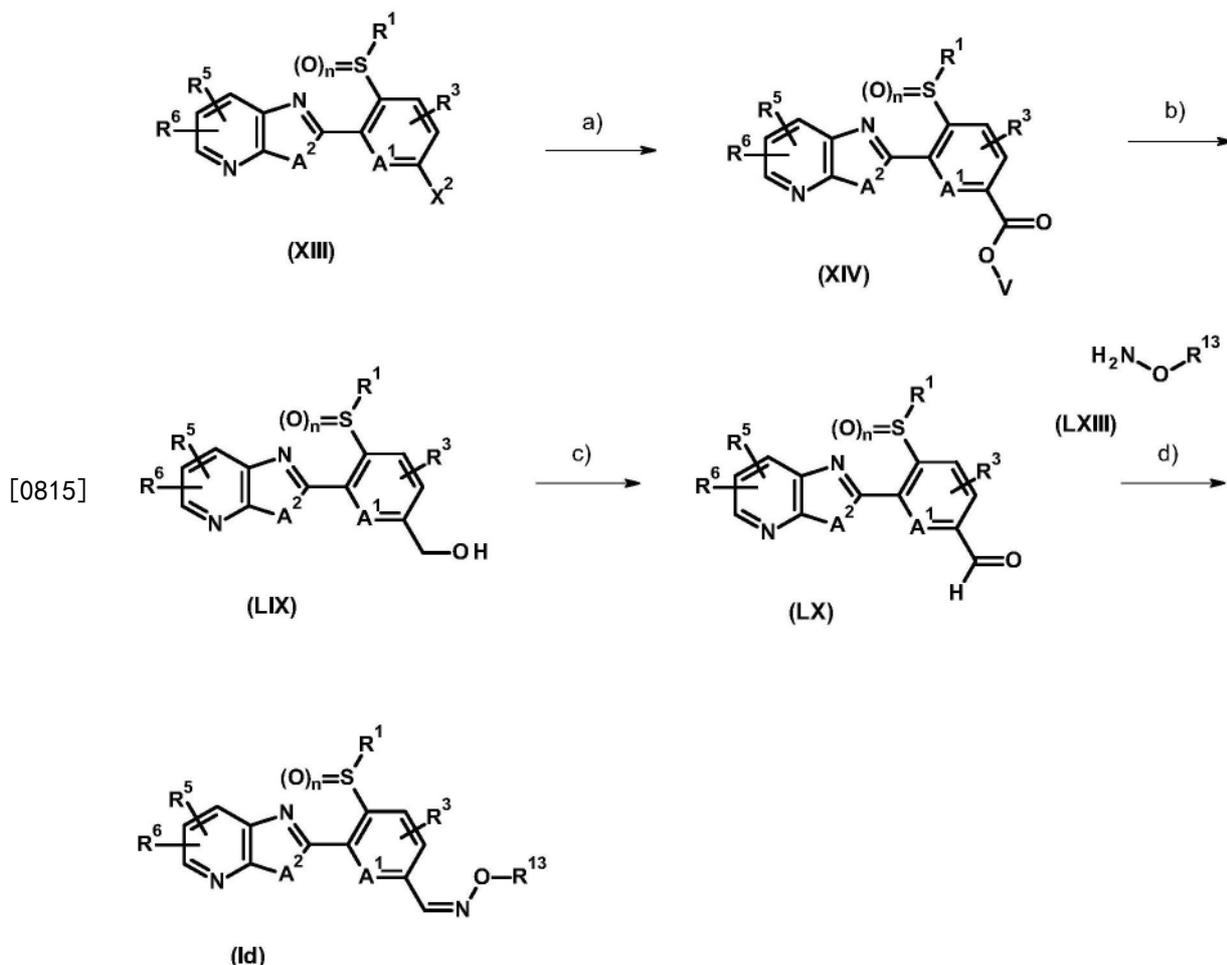
[0810] 在大多数情况下,至式 (LVII) 的化合物的转化在溶剂中进行,优选在腈例如乙腈或丙腈中,或在非质子极性溶剂例如N,N-二甲基甲酰胺或N-甲基吡咯烷酮中进行。

[0811] 该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在0℃至200℃的温度下进行。

[0812] 或者,式 (LV) 的化合物与式 (LVI) 的化合物反应得到式 (LVII) 的化合物也可以通过钯催化的N-芳基化来进行,例如类似于Angewandte Chemie Int.Ed.2011,50,8944-8947中所述的方法。

[0813] 式 (LVII) 的化合物至式 (I) 的化合物的进一步转化类似于方法A至M、Q、R、T和U进行。

[0814] 方法Q



[0816] 基团 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^{13} 、 A^1 和 n 具有上述含义， A^2 表示 $-\text{N}-\text{R}^7$ 、 O 或 S ，其中 R^7 具有上述含义。 X^2 表示卤素并且 V 表示 (C_1-C_4) 烷基。

[0817] 步骤a)

[0818] 式 (Id) 的化合物 (对应于式 I (G18)) 可以例如通过式 (XIII) 的化合物的羰基化来制备, 类似于 S.A. Vinogradov, D.F. Wilson, Tetrahedron Letters 39 (1998), 8935-8938。基团 V 优选为甲基、乙基、正丙基或正丁基。适合的反应催化剂为钯膦络合物, 例如氯化钯、三苯基膦和DPPP (1,3-双(二苯基膦)丙烷) (1:1:1) 的催化剂。优选的碱为例如Hünig氏碱 (二异丙基乙胺) 或DBU (1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯)。

[0819] 步骤b、c、d)

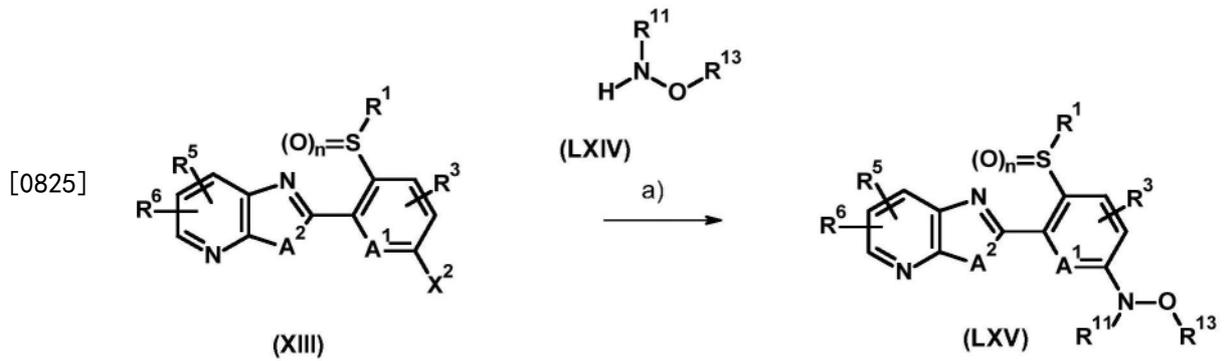
[0820] 式 (XIV) 的酯可以使用标准方法首先转化为式 (LIX) 的醇, 例如四氢硼酸钠或氢化铝锂的四氢呋喃或乙醇溶液, 参见W02004/14361、W02008/156757或US2006/235028。

[0821] 然后, 类似于W02006/81178或W02009/128019中所述的方法, 例如使用二氧化锰通过标准方法将式 (LIX) 的醇氧化成式 (LX) 的醛。

[0822] 式 (LXIII) 的化合物可商购获得或可通过已知方法制备。

[0823] 类似于W02014/102244, 通过标准方法用式 (LXIII) 的羟胺在稀释剂 (例如甲醇或乙醇中) 并任选地在酸 (例如乙酸) 的存在下而进一步转化得到本发明式 (Id) 的化合物。

[0824] 方法R



[0826] 基团 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^{13} 、 A^1 和 n 具有上述含义, A^2 表示-N- R^7 、O或S,其中 R^7 具有上述含义。 X^2 表示卤素。

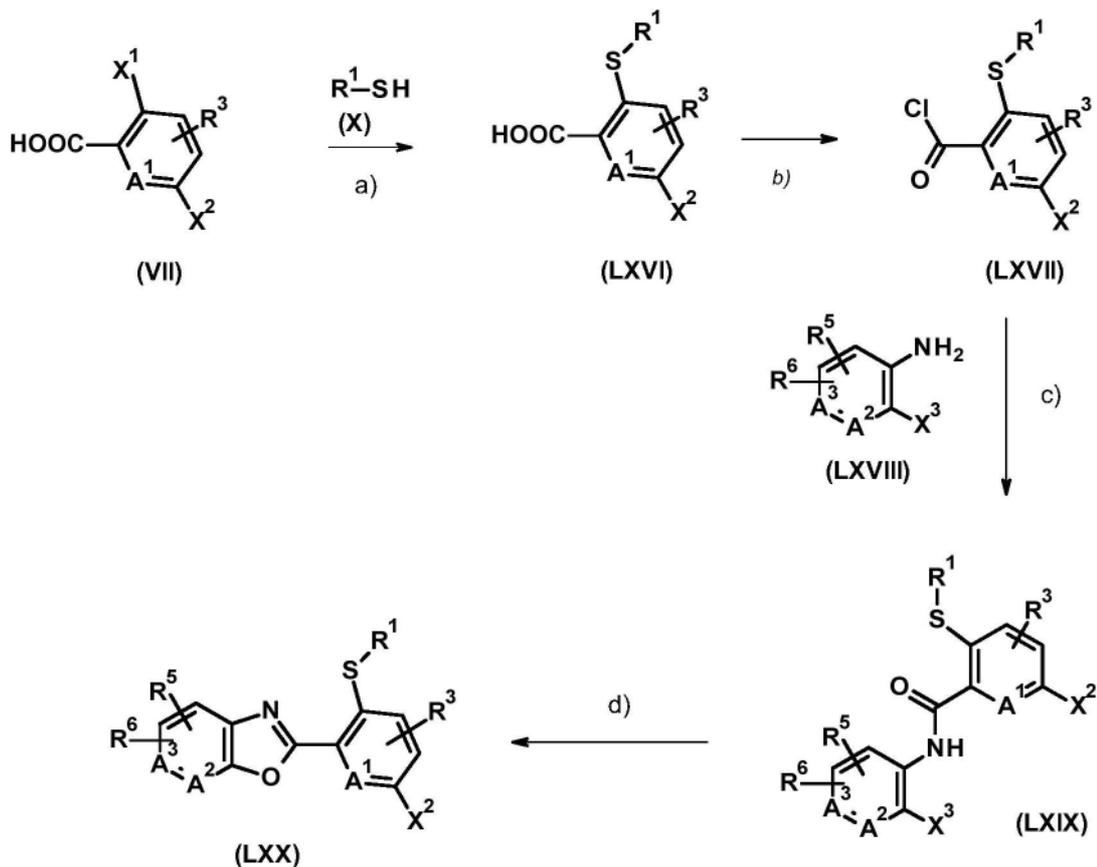
[0827] 式(LXV)的化合物(相当于式I(G15))可以通过使式(XIII)的化合物与式(LXIV)的化合物进行反应来制备。

[0828] 式(LXIV)的化合物可商购获得或可通过已知方法制备。

[0829] 反应在类似于方法E中所述的反应条件下进行。

[0830] 方法S

[0831] 作为方法A的替代方案,其中X表示H4、H5或H6的式(I)的化合物可以如下方式进行制备:



[0833] 基团 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 和 n 具有上述含义, A^2 和 A^3 表示CH或N, X^1 表示卤素, X^1 、 X^2 和 X^3 表示卤素, R^7 表示(C_1 - C_4)烷基。

[0834] 步骤a)

[0835] 式(LXVI)的化合物可以通过使式(VII)的化合物与式(X)的化合物在碱的存在下进行反应来制备。

[0836] 式(X)的硫醇衍生物,例如甲硫醇、乙硫醇或异丙硫醇可商购获得或可通过已知方法制备,例如类似于US2006/25633、US2006/111591、US2820062、Chemical Communications,13(2000),1163-1164或Journal of the American Chemical Society,44(1922),p.1329中所述的方法。

[0837] 至式(LXVI)的化合物的转化可以不用溶剂或在溶剂中进行,优选在选自常规溶剂的溶剂中进行反应,所述常规溶剂在主要反应条件下呈惰性。优选醚类,例如二异丙基醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、叔丁基甲基醚;腈类,例如乙腈或丙腈;芳族烃类,例如甲苯或二甲苯;非质子极性溶剂,例如N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮或二甲基亚砷。

[0838] 合适的碱的实例是选自碱金属或碱土金属的乙酸盐、磷酸盐和碳酸盐的无机碱。在此优选碳酸铯、碳酸钠和碳酸钾。其他合适的碱是碱金属氢化物,例如氢化钠。

[0839] 该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在0°C至200°C的温度下进行。

[0840] 步骤b)

[0841] 式(LXVII)的化合物可以通过一般常规方法使式(LXVI)的化合物与氯化剂(例如草酰氯或亚硫酰氯)进行反应来制备。

[0842] 步骤c)

[0843] 式(LXIX)的化合物可以通过式(LXVIII)的化合物与式(LXVII)的酰氯在碱的存在下进行反应来制备。

[0844] 式(LXVIII)的化合物可商购获得或可通过已知方法制备,例如类似于US2003/069257、US2012/0319050、W02011/107998或W02010/91310中所述的方法。

[0845] 式(LXVIII)的化合物与式(LXVII)的酰氯的反应可以不用溶剂或在溶剂中进行,优选在选自常规溶剂的溶剂中进行反应,所述常规溶剂在主要反应条件下呈惰性。优选醚类,例如二异丙基醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷;卤代烃类,例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯;腈类,例如乙腈或丙腈;芳族烃类,例如甲苯或二甲苯;非质子极性溶剂,例如N,N-二甲基甲酰胺或N-甲基吡咯烷酮,或含氮化合物,例如吡啶。

[0846] 合适的碱是通常用于这种反应的无机碱。优选使用例如选自有机胺碱、碱性芳族杂环化合物以及碱金属或碱土金属的乙酸盐、磷酸盐、碳酸盐和碳酸氢盐的碱。特别优选三乙胺、二异丙胺、吡啶、哌啶、乙酸钠、磷酸钠、磷酸钾、碳酸铯、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠、碳酸氢钾。其他合适的碱是碱金属氢化物如氢化钠,以及碱金属氢氧化物如NaOH、KOH和LiOH。

[0847] 该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在0°C至180°C的温度下进行;其中优选地,反应在大气压下和20至140°C的温度下进行。

[0848] 步骤d)

[0849] 式(LXX)的化合物可以通过将式(LXIX)的化合物在碱的存在下进行缩合来制备。

[0850] 至式(LXX)的化合物的转化可以不用溶剂或在溶剂中进行,优选在选自常规溶剂的溶剂中进行反应,所述常规溶剂在主要反应条件下惰性的。优选醚类,例如二异丙基醚、二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、叔丁基甲基醚;卤代烃类,例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或氯苯;腈类,例如乙腈或丙腈;芳族烃类,例如甲苯或二甲苯;非质子

极性溶剂,例如N,N-二甲基甲酰胺或N-甲基吡咯烷酮,或氮化合物,例如吡啶。

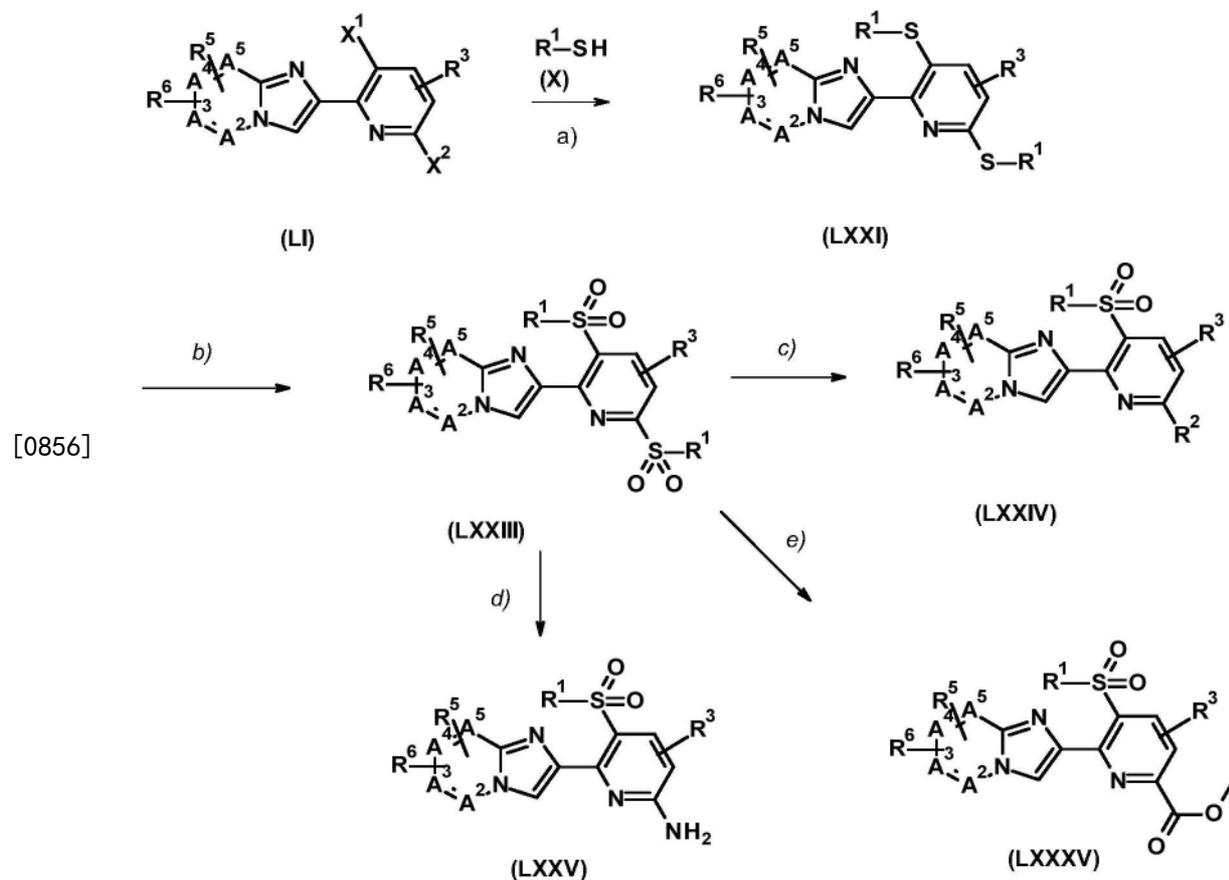
[0851] 合适的碱是通常用于此类反应的无机碱。优选使用例如选自碱金属或碱土金属的乙酸盐、磷酸盐、碳酸盐和碳酸氢盐的碱。此处特别优选乙酸钠、磷酸钠、磷酸钾、碳酸铯、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠、碳酸氢钾。

[0852] 该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在0°C至200°C的温度下进行。

[0853] 式(LXX)的化合物进一步转化为式(I)的化合物类似于方法A至M、Q、R、T和U进行。

[0854] 方法T

[0855] 其中X表示H1、H2、H4、H5、H6、H7、H8、H9、H10、H11、H14、H15、H16、H17、H19或H20的式(I)的化合物可以可选地根据以下方法制备。下面参考实施例H10、H11、H15和H16描述该方法。



[0857] 基团R¹、R²、R³、R⁵和R⁶具有上述含义,A²至A⁵表示CH或N,X¹和X²表示卤素。

[0858] 步骤a)

[0859] 类似于方法A步骤c),也可以形成式(LXXI)的二硫化物而不是硫化物。

[0860] 步骤b)

[0861] 可以类似于方法A步骤f)将二硫化物转化为式(LXXIII)的二砷。

[0862] 步骤c)

[0863] 类似于式(XIII)的化合物,二砷适合作为用于制备式(LXXIV)的化合物的原料,其中R²表示N-连接的环。在这方面参见方法A步骤g)。

[0864] 步骤d)

[0865] 类似地,式(LXXIII)的二砷可以用于制备式(LXXV)的胺,其可以部分用作进一步

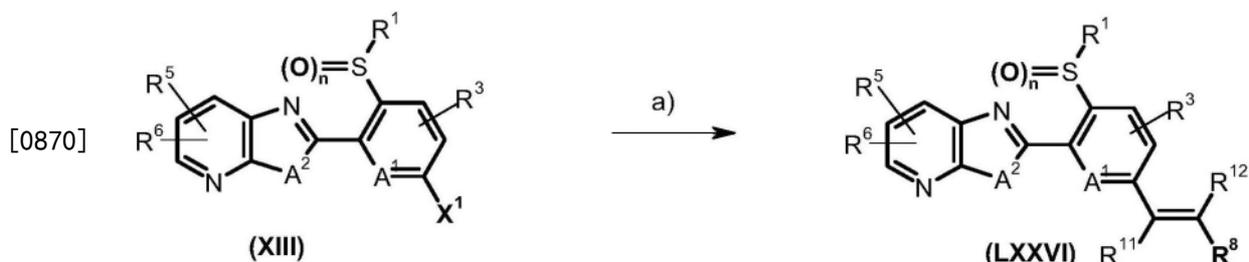
衍生化的原料。式 (LXXV) 的胺的转化类似于方法D步骤a) 进行。

[0866] 步骤e)

[0867] 类似于方法Q步骤a), 式 (XXIII) 的二砜也可以在合适的钯催化剂的存在下羰基化, 并且通过加入甲醇将其转化为式 (LXXXV) 的甲酯。

[0868] 方法T也可用于制备式 (IX) 的化合物。

[0869] 方法U



[0871] 基团 R^1 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^{11} 、 R^{12} 、 A^1 和 n 具有上述含义, A^2 表示 $-N-R^7$ 、 O 或 S ,其中 R^7 具有上述含义并且 X^1 表示卤素。

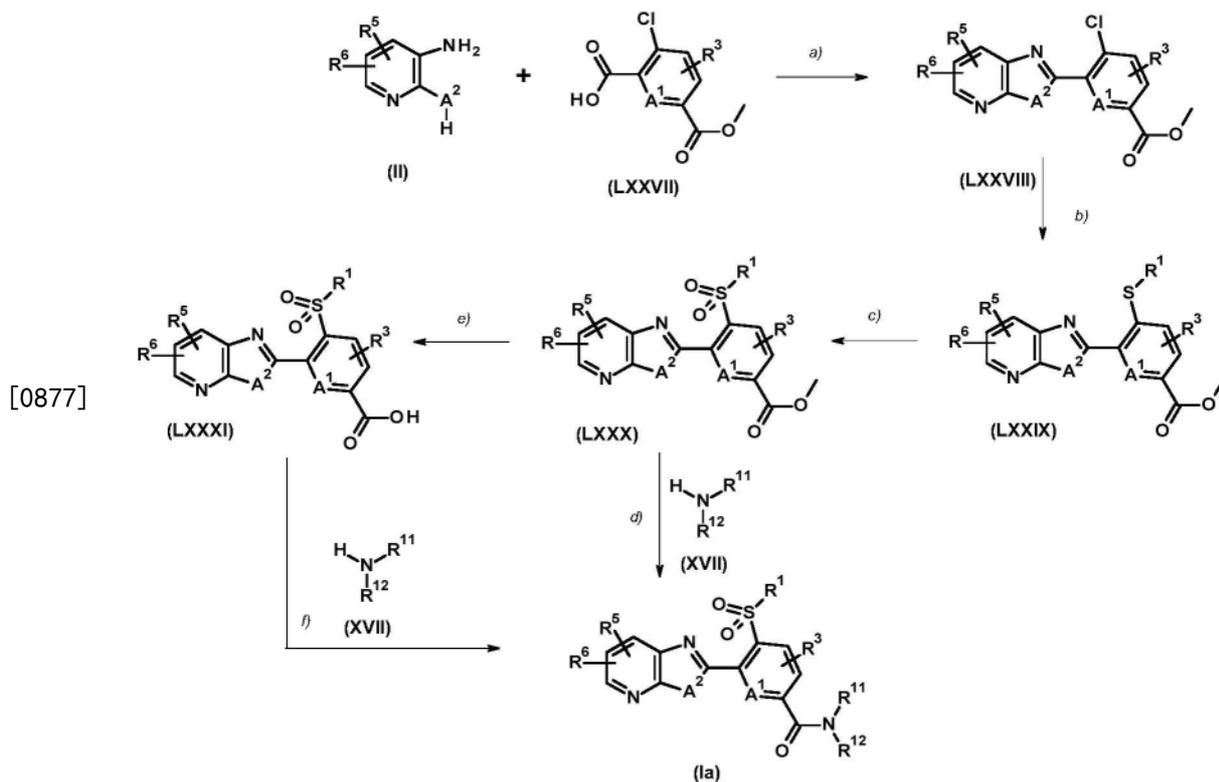
[0872] 步骤a)

[0873] 式 (LXXVI) 的化合物 (对应于I (G19)) 可以通过通常已知的方法例如由其中 X^1 优选表示选自氯或溴的卤素的式 (XIII) 的化合物进行制备 (参见Chem. Rev. 1995, 95, 2457-2483; Tetrahedron 2002, 58, 9633-9695; Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions (编者:A. de Meijere, F. Diederich), 第2版, Wiley-VCH, Weinheim, 2004)。

[0874] 例如, 式 (XIII) 的化合物可以在选自过渡金属盐的合适催化剂的存在下, 通过已知方法 (参见W02006/21805) 与合适的烯炔硼酸或其酯进行反应而得到式 (LXXVI) 的化合物。优选的偶联催化剂的实例包括钯催化剂, 例如[1, 1'-双(二苯基膦)二茂铁]二氯化钯(II) 或四(三苯基膦)钯。用于进行该方法的合适的碱性反应助剂优选为钠或钾的碳酸盐。

[0875] 所需的某些烯炔硼酸或烯炔硼酸酯是已知的和/或可商购获得, 或者它们可以通过通常已知的方法制备 (参见Boronic Acids (编者:D. G. Hall), 第2版, Wiley-VCH, Weinheim, 2011)。

[0876] 方法V



[0878] 基团R¹、R³、R⁵、R⁶、R¹¹、R¹²、A¹具有上述含义。A²表示-N-R⁷、O或S。

[0879] 步骤a)

[0880] 类似于方法A步骤a)和b),由式(LXXVII)的化合物起始可以形成式(LXXVIII)的化合物,而不是式(VII)的化合物。

[0881] 式(LXXVII)的化合物可商购获得或可通过已知方法制备,参见例如European Journal of Medicinal Chemistry,2015,(90),170。

[0882] 步骤b)

[0883] 类似于方法A步骤c),式(LXXVIII)的化合物可转化为式(LXXIX)的硫化物。

[0884] 步骤c)

[0885] 类似于方法A步骤f),可以将式(LXXIX)的化合物氧化成式(LXXX)的砜。

[0886] 步骤d)

[0887] 如果R¹¹=H且R¹²=烷基(优选甲基),则式(LXXX)的化合物可以通过与相应的式(XVII)的胺在合适的溶剂中,并任选在催化剂(如MgCl₂)的存在下进行反应而直接转化为式(Ia)的化合物(对应于I(G3))。在这方面参见例如W02004/37789、US2003/144278或US2013/35492。

[0888] 步骤e)

[0889] 作为步骤d)的替代方案,式(LXXX)的化合物可通过通常已知的方法进行皂化而得到酸(式(LXXXI)的化合物)。

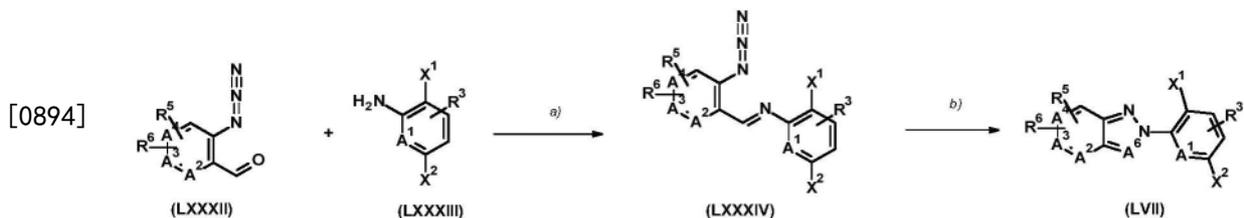
[0890] 步骤f)

[0891] 为了转化为式(Ia)的酰胺(对应于I(G3)),从式(LXXXI)的化合物起始可以采用多种方法。例如,可以参考在缩合剂例如碳化二亚胺(如1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳化二亚胺盐酸盐(EDCI)或1,3-二环己基碳化二亚胺(CDI))和碱(如N,N-二甲基吡啶-4-胺

(DMAP))的存在下,由酸制备酰胺的一般常规方法。

[0892] 方法W

[0893] 作为方法P的替代方案,其中X是H3、H18或H20的式(I)的化合物可以如下方式制备:



[0895] 基团R⁵、R⁶、A¹具有上述含义,A²至A⁴表示CH或N,A⁶仅表示CH,X¹和X²表示卤素。

[0896] 步骤a)

[0897] 式(LXXXIV)的化合物可以通过使式(LXXXII)的化合物与式(LXXXIII)的化合物缩合来制备,如Chemical Communications,2011,第47卷,第10133-10135页,W02012/66061A1,2012,Tetrahedron,1992,第48卷,第3091-3110页所述。

[0898] 式(LXXXII)的化合物可商购获得或可通过已知方法制备,参见例如类似于W02012/66061或Australian Journal of Chemistry,1980,33,91的方法。

[0899] 式(LXXXIII)的化合物可商购获得或可通过已知方法制备,参见例如W02007/87549。

[0900] 缩合可以不用溶剂或在溶剂中进行,优选在选自常规溶剂的溶剂中进行反应,所述常规溶剂在主要反应条件下呈惰性。优选醇类如乙醇或甲醇或醚类如THF。

[0901] 该反应通过使用Broenstedt酸或路易斯酸来催化,特别优选乙酸和钛盐如四氯化钛或四乙醇钛。

[0902] 步骤b)

[0903] 类似于W02012/66061A1或Organic Letters,2011,第13卷,第3542-3545页,将式(LXXXIV)的化合物进行环化而得到式(LVII)的化合物。环化可以不用溶剂或在溶剂中进行,优选在选自常规溶剂的溶剂中进行反应,所述常规溶剂在主要反应条件下呈惰性。特别优选高沸点溶剂如甲苯或DMSO。

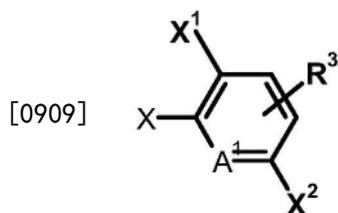
[0904] 该反应可以在减压下、在大气压下或在高压下和在0℃至200℃的温度下进行。优选高于100℃的温度。

[0905] 该反应可以通过加入铜(I)盐来催化。

[0906] 式(LVII)的化合物至式(I)的化合物的进一步转化类似于方法A至M、Q、R、T和U进行。

[0907] 方案A至W中式(I)至(LXXXIV)的化合物例如参考选自系列H1至H20的特定X取代基进行描述,但也适用于选自系列H1至H20的类似X取代基。

[0908] 本发明还提供了式(IX)的化合物



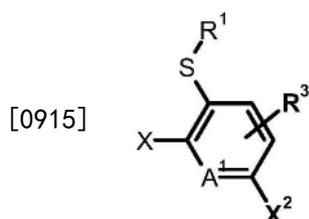
[0910] 其中

[0911] X、A¹和R³具有上述含义，X¹表示卤素，X²表示卤素。

[0912] 优选地，A¹表示N，R³表示氢，X¹表示溴、氟或氯，X²表示氟或氯。

[0913] 特别优选地，A¹表示N，R³表示氢，X¹表示氟或氯，X²表示氟或氯，X具有上述含义，其中X不表示H1、H2、H4、H5、H6、H7、H8、H9或H14。

[0914] 本发明还提供了式 (XI) 的化合物



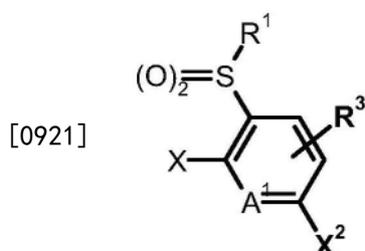
[0916] 其中

[0917] X、A¹、R¹和R³具有上述含义，X²表示卤素。

[0918] 优选地，A¹表示N，R¹表示乙基，R³表示氢，X²表示氟或氯。

[0919] 特别优选地，A¹表示N，R¹表示乙基，R³表示氢，X²表示氟或氯，X具有上述含义，其中X不表示H1、H2、H4、H5、H6、H7、H8、H9或H14。

[0920] 本发明还提供了式 (XIII) 的化合物



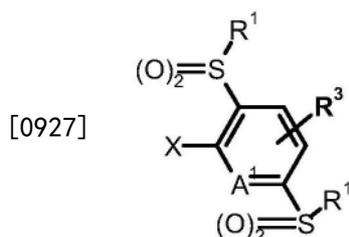
[0922] 其中

[0923] X、A¹、R¹和R³具有上述含义，X²表示卤素。

[0924] 优选地，A¹表示N，R¹表示乙基，R³表示氢，X²表示氟或氯。

[0925] 特别优选地，A¹表示N，R¹表示乙基，R³表示氢，X²表示氟或氯，X具有上述含义，其中X不表示H1、H2、H4、H5、H6、H7、H8、H9或H14。

[0926] 本发明还提供了式 (LXXIII) 的化合物



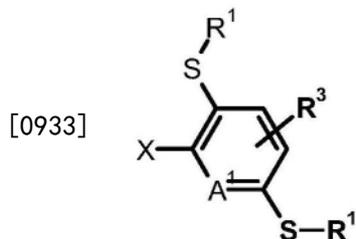
[0928] 其中

[0929] X、A¹、R¹和R³具有上述含义。

[0930] 优选地，A¹表示N，R¹表示乙基，R³表示氢。

[0931] 特别优选地，A¹表示N，R¹表示乙基，R³表示氢，X具有上述含义，其中X不表示H1、H2、H4、H5、H6、H7、H8、H9或H14。

[0932] 本发明还提供了式 (LXXI) 的化合物



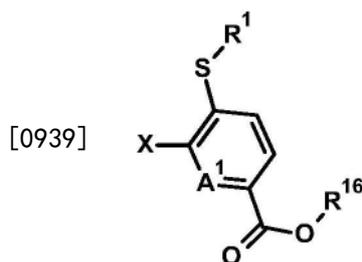
[0934] 其中

[0935] X、A¹、R¹和R³具有上述含义。

[0936] 优选地，A¹表示N，R¹表示乙基，R³表示氢。

[0937] 特别优选地，A¹表示N，R¹表示乙基，R³表示氢，X具有上述含义，其中X不表示H1、H2、H4、H5、H6、H7、H8、H9或H14。

[0938] 本发明还提供了式 (LXXIX) 的化合物

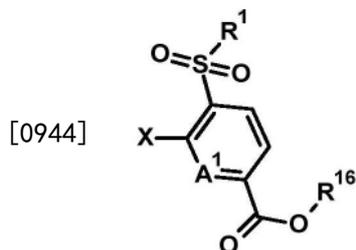


[0940] 其中

[0941] X、A¹和R¹具有上述含义，R¹⁶表示甲基、乙基或丙基。

[0942] 优选地，A¹表示N，R¹表示乙基，R¹⁶表示甲基。

[0943] 本发明还提供了式 (LXXX) 的化合物



[0945] 其中

[0946] X、A¹和R¹具有上述含义，R¹⁶表示甲基、乙基或丙基。

[0947] 优选地，A¹表示N，R¹表示乙基，R¹⁶表示甲基。

[0948] 方法和用途

[0949] 本发明还涉及用于防治动物害虫的方法，其中式 (I) 的化合物可以作用于动物害虫和/或其生境。所述动物害虫的防治优选在农业和林业中、以及在材料保护中进行。从其

中优选排除的方法是用于人体或动物体的外科或治疗处理的方法以及在人体或动物体上实施的诊断方法。

[0950] 本发明还涉及式 (I) 的化合物用作农药的用途, 尤其是用作作物保护剂的用途。

[0951] 在本申请的上下文中, 术语“农药”通常还包括术语“作物保护剂”。

[0952] 具有良好的植物耐受性、有利的恒温动物毒性和良好的环境相容性的式 (I) 的化合物适用于: 保护植物和植物器官抵抗生物和非生物胁迫因素、提高采收产率、改善采收材料的品质以及防治在农业、园艺业、畜牧业、水产养殖业、林业、园林和休闲设施、储存产品和材料的保护以及卫生领域中遇到的动物害虫, 尤其是昆虫、蛛形纲、蠕虫、线虫和软体动物。

[0953] 在本专利申请的上下文中, 术语“卫生”被理解为意指旨在预防疾病-特别是感染性疾病-并且旨在用于保持人类、动物和/或环境健康, 和/或旨在保持清洁的全部所有措施、方法和过程。根据本发明, 术语“卫生”尤其包括用于清洁、消毒和灭菌如主要由玻璃、木材、混凝土、瓷器、陶瓷、塑料制成或由金属(多种金属)制成的纺织品或硬质表面, 并保持它们不沾染卫生害虫和/或其排泄物的措施。在这方面, 根据本发明排除的方法还是用于人体或动物体的外科或治疗处理的方法以及在人体或动物体上实施的诊断方法。

[0954] 因此, 术语“卫生领域”包括这样的卫生措施、方法和过程是重要的所有领域、技术领域和商业应用, 例如在厨房、面包房、机场、浴场、游泳池、购物中心、酒店、医院、马厩等中的卫生。

[0955] 因此, 术语“卫生害虫”被理解为意指其在卫生领域中的存在是有问题的, 特别是出于健康原因的一种或多种动物害虫。因此, 主要目的是减少或预防卫生害虫或在卫生领域中与其接触。这可以特别通过使用农药来实现, 其中该试剂可以预防性使用以及仅在感染情况下使用以防治害虫。也可以使用通过避免或减少与害虫接触而起作用的试剂。例如, 卫生害虫为下文提及的生物体。

[0956] 因此, 术语“卫生防护”包括用于维持和/或改善这种卫生措施、方法和过程的所有行为。

[0957] 式 (I) 的化合物可优选用作农药。它们能有效抵抗通常敏感和抗性的物种, 以及抵抗所有或某些发育阶段。上述害虫包括:

[0958] 节肢动物门 (Arthropoda)、尤其是蛛形纲 (Arachnida) 的害虫, 例如粉螨属 (例如粗脚粉螨 (*Acarus siro*)、枸杞瘤瘿螨 (*Aceria kuko*)、柑橘瘤瘿螨 (*Aceria sheldoni*)、刺皮瘿螨属 (*Aculops* spp.)、针刺瘿螨属 (*Aculus* spp.) (例如佛氏刺瘿螨 (*Aculus fockeui*)、苹果刺瘿螨 (*Aculus schlechtendali*)、花蜱属 (*Amblyomma* spp.)、山楂叶螨 (*Amphitetranychus viennensis*)、锐缘蜱属 (*Argas* spp.)、牛蜱属 (*Boophilus* spp.)、短须螨属 (*Brevipalpus* spp.) (例如紫红短须螨 (*Brevipalpus phoenicis*))、蚜苔螨 (*Bryobia graminum*)、苜蓿苔螨 (*Bryobia praetiosa*)、刺尾蝎属 (*Centruroides* spp.)、皮螨属 (*Chorioptes* spp.)、鸡皮刺螨 (*Dermanyssus gallinae*)、欧洲屋尘螨 (*Dermatophagoides pteronyssinus*)、美洲屋尘螨 (*Dermatophagoides farinae*)、革蜱属 (*Dermacentor* spp.)、始叶螨属 (*Eotetranychus* spp.) (例如核桃始叶螨 (*Eotetranychus hicoriae*))、梨上瘿螨 (*Epitrimerus pyri*)、真叶螨属 (*Eutetranychus* spp.) (例如班氏真叶螨 (*Eutetranychus banksi*))、瘿螨属 (*Eriophyes* spp.) (例如梨瘿螨 (*Eriophyes*

pyri)、家甜食螨(*Glycyphagus domesticus*)、红足海镰螯螨(*Halotydeus destructor*)、半跗线螨属(*Hemitarsonemus* spp.) (例如茶半跗线螨(*Hemitarsonemus latus*) (=侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonemus latus*))、璃眼蜱属(*Hyalomma* spp.)、硬蜱属(*Ixodes* spp.)、毒蛛属(*Latrodectus* spp.)、斜蛛属(*Loxosceles* spp.)、秋收恙螨(*Neutrombicula autumnalis*)、*Nuphessa* spp.、小爪螨属(*Oligonychus* spp.) (例如跗线螨(*Oligonychus coffeae*)、*Oligonychus coniferarum*、冬青小爪螨(*Oligonychus ilicis*)、甘蔗小爪螨(*Oligonychus indicus*)、芒果小爪螨(*Oligonychus mangiferus*)、草地小爪螨(*Oligonychus pratensis*)、石榴小爪螨(*Oligonychus punicae*)、樟小爪螨(*Oligonychus yothersi*))、钝缘蜱属(*Ornithodoros* spp.)、禽刺螨属(*Ornithonyssus* spp.)、全爪螨属(*Panonychus* spp.) (例如柑桔全爪螨(*Panonychus citri*) (=Metatetranychus citri))、苹果全爪螨(*Panonychus ulmi*) (=Metatetranychus ulmi))、柑桔锈螨(*Phyllocoptruta oleivora*)、多趾宽叶螨(*Platytetranychus multidigituli*)、侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonemus latus*)、痒螨属(*Psoroptes* spp.)、扇头蜱属(*Rhipicephalus* spp.)、根螨属(*Rhizoglyphus* spp.)、疥螨属(*Sarcoptes* spp.)、中东金蝎(*Scorpio maurus*)、狭跗线螨种(*Stenotarsonemus* spp.)、稻细螨(*Steneotarsonemus spinki*)、跗线螨属(*Tarsonemus* spp.) (例如乱跗线螨(*Tarsonemus confusus*)、樱草狭跗线螨(*Tarsonemus pallidus*))、叶螨属(*Tetranychus* spp.) (例如加拿大叶螨(*Tetranychus canadensis*)、朱砂叶螨(*Tetranychus cinnabarinus*)、土耳其斯坦叶螨(*Tetranychus turkestanii*)、二斑叶螨(*Tetranychus urticae*))、阿氏真恙螨(*Trombicula alfreddugesi*)、*Vaejovis* spp.、番茄斜背瘤瘿螨(*Vasates lycopersici*)；

[0959] 唇足纲(*Chilopoda*)的害虫,例如,地蜈蚣属(*Geophilus* spp.)、蚰蜒属(*Scutigera* spp.)；

[0960] 弹尾目或弹尾纲(*Collembola*)的害虫,例如,武装棘跳虫(*Onychiurus armatus*)；绿圆跳虫(*Sminthurus viridis*)；

[0961] 倍足纲(*Diplopoda*)的害虫,例如,千足虫(*Blaniulus guttulatus*)；

[0962] 昆虫纲的害虫,例如蜚蠊目(*Blattodea*),如东方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、亚洲蜚蠊(*Blattella asahinai*)、德国小蠊(*Blattella germanica*)、马德拉蜚蠊(*Leucophaea maderae*)、*Loboptera decipiens*、家屋斑蠊(*Neostylopyga rhombifolia*)、古巴蠊属(*Panchlora* spp.)、木蠊属(*Parcoblatta* spp.)、大蠊属(*Periplaneta* spp.) (例如美洲大蠊(*Periplaneta americana*)、澳洲大蠊(*Periplaneta australasiae*))、蔗蠊(*Pycnoscelus surinamensis*)、棕带蜚蠊(*Supella longipalpa*)；

[0963] 鞘翅目(*Coleoptera*)的害虫,例如,条纹南瓜甲(*Acalymma vittatum*)、菜豆象(*Acanthoscelides obtectus*)、喙丽金龟属(*Adoretus* spp.)、小蜂窝甲虫(*Aethina tumida*)、杨树萤叶甲(*Agelastica alni*)、叩甲属(*Agriotes* spp.) (例如直条叩头虫(*Agriotes linneatus*)、小麦叩头虫(*Agriotes mancus*))、黑菌虫(*Alphitobius diaperinus*)、马铃薯鳃角金龟(*Amphimallon solstitialis*)、家具窃蠹(*Anobium punctatum*)、星天牛属(*Anoplophora* spp.)、花象属(*Anthonomus* spp.) (例如棉铃象甲(*Anthonomus grandis*))、圆皮蠹属(*Anthrenus* spp.)、梨象属(*Apion* spp.)、阿鳃金龟属(*Apogonia* spp.)、隐食甲属(*Atomaria* spp.) (例如甜菜隐食甲(*Atomaria linearis*))、毛

皮蠹属(*Attagenus* spp.)、*Baris caerulescens*、恶条豆象(*Bruchidius obtectus*)、豆象属(*Bruchus* spp.) (例如豌豆象(*Bruchus pisorum*)、蚕豆象(*Bruchus rufimanus*))、龟叶甲属(*Cassida* spp.)、菜豆莢叶甲(*Cerotoma trifurcata*)、龟象属(*Ceuthorhynchus* spp.) (例如白菜籽龟象(*Ceutorrhynchus assimilis*)、甘蓝莖龟象(*Ceutorrhynchus quadridens*)、白菜龟象(*Ceutorrhynchus rapae*))、跳甲属(*Chaetocnema* spp.) (例如甘薯跳甲(*Chaetocnema confinis*)、美国齿跳甲(*Chaetocnema denticulata*)、荒地玉米跳甲(*Chaetocnema ectypa*)、*Cleonus mendicus*、宽胸叩头虫属(*Conoderus* spp.)、根颈象属(*Cosmopolites* spp.) (例如香蕉根颈象甲(*Cosmopolites sordidus*))、褐新西兰肋翅鳃金龟(*Costelytra zealandica*)、叩甲属(*Ctenicera* spp.)、象虫属(*Curculio* spp.) (例如美核桃象(*Curculio caryae*)、大栗象(*Curculio caryatrypes*)、美洲榛子象(*Curculio obtusus*)、小栗象(*Curculio sayi*))、锈赤扁谷盗(*Cryptolestes ferrugineus*)、长角扁谷盗(*Cryptolestes pusillus*)、杨干隐喙(*Cryptorhynchus lapathi*)、芒果果核象甲(*Cryptorhynchus mangiferae*)、细枝象属(*Cylindrocopturus* spp.)、密点细枝象(*Cylindrocopturus adpersus*)、洋松细枝象(*Cylindrocopturus furnissi*)、皮蠹属(*Dermestes* spp.)、叶甲属(*Diabrotica* spp.) (例如带斑黄瓜条叶甲(*Diabrotica balteata*)、北方玉米根叶甲(*Diabrotica barberi*)、南方十一星瓜叶甲(*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、南方十一星瓜叶甲亚种(*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*)、西方玉米根叶甲(*Diabrotica virgifera virgifera*)、墨西哥玉米根叶甲(*Diabrotica virgifera zea*))、蛀野螟属(*Dichocrocis* spp.)、水稻铁甲(*Di cladispa armigera*)、*Diloboderus* spp.、*Epicaerus* spp.、食植瓢虫属(*Epilachna* spp.) (例如瓜食植瓢虫(*Epilachna borealis*)、墨西哥豆瓢虫(*Epilachna varivestis*))、毛跳甲属(*Epitrix* spp.) (例如黄瓜跳甲(*Epitrix cucumeris*)、茄子跳甲(*Epitrix fuscula*)、烟草跳甲(*Epitrix hirtipennis*)、美国马铃薯跳甲(*Epitrix subcrinita*)、块茎跳甲(*Epitrix tuberis*))、钻孔虫属(*Faustinus* spp.)、裸蛛甲(*Gibbium psylloides*)、阔角谷盗(*Gnathocerus cornutus*)、菜心野螟(*Hellula undalis*)、黑异爪蔗金龟(*Heteronychus arator*)、寡节鳃金龟属(*Heteronyx* spp.)、*Hylamorpha elegans*、北美家天牛(*Hylotrupes bajulus*)、紫苜蓿叶象(*Hypera postica*)、蓝绿象(*Hypomeces squamosus*)、咪小蠹属(*Hypothenemus* spp.) (例如咖啡果小蠹(*Hypothenemus hampei*)、苹枝小囊(*Hypothenemus obscurus*)、毛竹小蠹(*Hypothenemus pubescens*))、甘蔗大褐齿爪鳃金龟(*Lachnosterna consanguinea*)、烟草甲(*Lasioderma serricorne*)、长头谷盗(*Latheticus oryzae*)、波缘薪甲属(*Lathridius* spp.)、负泥虫属(*Lema* spp.)、马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata*)、潜叶蛾属(*Leucoptera* spp.) (例如咖啡潜叶蛾(*Leucoptera coffeella*))、稻根象(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、*Listronotus* (= *Hyperodes*) spp.、筒喙象属(*Lixus* spp.)、*Luperodes* spp.、黄胸寡毛跳甲(*Luperomorpha xanthodera*)、粉蠹属(*Lyctus* spp.)、美洲叶甲属(*Megascelis* spp.)、梳爪叩头虫属(*Melanotus* spp.) (例如*Melanotus longulus oregonensis*)、油菜花露尾甲(*Meligethes aeneus*)、鳃金龟属(*Melolontha* spp.) (例如欧洲鳃金龟(*Melolontha melolontha*))、*Migdolus* spp.、墨天牛属(*Monochamus* spp.)、象甲(*Naupactus xanthographus*)、隐跗郭公虫属(*Necrobia* spp.)、*Neogalerucella* spp.、黄蛛甲(*Niptus hololeucus*)、椰蛀犀金

龟(*Oryctes rhinoceros*)、锯谷盗(*Oryzaephilus surinamensis*)、*Oryzaphagus oryzae*、耳喙象属(*Otiorrhynchus* spp.) (例如苹果耳喙象(*Otiorhynchus cribricollis*)、苜蓿耳喙象(*Otiorhynchus ligustici*)、草莓耳喙象(*Otiorhynchus ovatus*)、粗糙草莓耳喙象(*Otiorhynchus rugosostriatus*)、黑葡萄耳喙象(*Otiorhynchus sulcatus*))、负泥虫属(*Oulema* spp.) (例如橙足负泥虫(*Oulema melanopus*)、稻负泥虫(*Oulema oryzae*))、小青花金龟(*Oxycetonia jucunda*)、辣根猿叶虫(*Phaedon cochleariae*)、食叶鳃金龟属(*Phyllophaga* spp.)、鳃金龟(*Phyllophaga helleri*)、黄条跳甲属(*Phyllotreta* spp.) (例如辣根条跳甲(*Phyllotreta armoraciae*)、西方黑跳甲(*Phyllotreta pusilla*)、美条纹跳甲(*Phyllotreta ramosa*)、黄曲条跳甲(*Phyllotreta striolata*))、日本弧丽金龟(*Popillia japonica*)、象甲属(*Premnotrypes* spp.)、大谷蠹(*Prostephanus truncatus*)、跳甲属(*Psylliodes* spp.) (例如马铃薯跳甲(*Psylliodes affinis*)、油菜兰跳甲(*Psylliodes chrysocephala*)、忽布跳甲(*Psylliodes punctulata*))、蛛甲属(*Ptinus* spp.)、暗色瓢虫(*Rhizobius ventralis*)、谷蠹(*Rhizopertha dominica*)、隐喙象属(*Rhynchophorus* spp.)、红棕象甲(*Rhynchophorus ferrugineus*)、棕榈象甲(*Rhynchophorus palmarum*)、*Sinoxylon perforans*、谷象属(*Sitophilus* spp.) (例如谷象(*Sitophilus granarius*)、罗望子象(*Sitophilus linearis*)、米象(*Sitophilus oryzae*)、玉米象(*Sitophilus zeamais*))、尖隐喙象属(*Sphenophorus* spp.)、药材甲(*Stegobium paniceum*)、茎干象属(*Sternechus* spp.) (例如豆茎象(*Sternechus paludatus*))、宽幅天牛属(*Symphyletes* spp.)、纤毛象属(*Tanymecus* spp.) (例如双宽隆突纤毛象(*Tanymecus dilaticollis*)、印度纤毛象(*Tanymecus indicus*)、红豆草灰象甲(*Tanymecus palliatus*))、黄粉虫(*Tenebrio molitor*)、大谷盗(*Tenebrioides mauretanicus*)、拟谷盗属(*Tribolium* spp.) (例如美洲黑拟谷盗(*Tribolium audax*)、赤拟谷盗(*Tribolium castaneum*)、杂拟谷盗(*Tribolium confusum*))、斑皮蠹属(*Trogoderma* spp.)、籽象属(*Tychius* spp.)、脊虎天牛属(*Xylotrechus* spp.)、距步甲属(*Zabrus* spp.) (例如玉米距步甲(*Zabrus tenebrioides*))；

[0964] 革翅目(Dermaptera)的害虫,例如,肥螽(*Anisolabis maritime*)、欧洲球螽(*Forficula auricularia*)、溪岸螽螋(*Labidura riparia*)；

[0965] 双翅目(Diptera)的害虫,例如,伊蚊属(*Aedes* spp.) (例如埃及伊蚊(*Aedes aegypti*)、白纹伊蚊(*Aedes albopictus*)、叮刺伊蚊(*Aedes sticticus*)、骚扰伊蚊(*Aedes vexans*))、潜蝇属(*Agromyza* spp.) (例如苜蓿斑潜蝇(*Agromyza frontella*)、美洲黍潜蝇(*Agromyza parvicornis*))、按实蝇属(*Anastrepha* spp.)、按蚊属(*Anopheles* spp.) (例如四斑按蚊(*Anopheles quadrimaculatus*)、冈比亚按蚊(*Anopheles gambiae*))、瘿蚊属(*Asphondylia* spp.)、果实蝇属(*Bactrocera* spp.) (例如瓜实蝇(*Bactrocera cucurbitae*)、东方果实蝇(*Bactrocera dorsalis*)、油橄榄果实蝇(*Bactrocera oleae*))、花园毛蚊(*Bibio hortulanus*)、天青丽蝇(*Calliphora erythrocephala*)、红头丽蝇(*Calliphora vicina*)、地中海实蝇(*Ceratitis capitata*)、摇蚊属(*Chironomus* spp.)、金蝇属(*Chrysomya* spp.)、斑虻属(*Chrysops* spp.)、高额麻虻(*Chrysozona pluvialis*)、锥蝇属(*Cochliomya* spp.)、康瘿蚊属(*Contarinia* spp.) (例如葡萄瘿蚊(*Contarinia johnsoni*)、甘蓝瘿蚊(*Contarinia nasturtii*)、梨实康瘿蚊(*Contarinia pyrivora*)、向日

葵瘿蚊 (*Contarinia schulzi*)、高粱康瘿蚊 (*Contarinia sorghicola*)、麦黄康瘿蚊 (*Contarinia tritici*)、人皮蝇 (*Cordylobia anthropophaga*)、环足摇蚊 (*Cricotopus sylvestris*)、库蚊属 (*Culex* spp.) (例如尖音库蚊 (*Culex pipiens*)、致乏库蚊 (*Culex quinquefasciatus*))、库蠓属 (*Culicoides* spp.)、脉毛蚊属 (*Culiseta* spp.)、黄蝇属 (*Cuterebra* spp.)、橄榄大实蝇 (*Dacus oleae*)、叶瘿蚊属 (*Dasyneura* spp.) (例如油菜叶瘿蚊 (*Dasineura brassicae*))、地种蝇属 (*Delia* spp.) (例如葱蝇 (*Delia antiqua*)、麦种蝇 (*Delia coarctata*)、毛跗地种蝇 (*Delia florilega*)、灰地种蝇 (*Delia platura*)、甘蓝地种蝇 (*Delia radicum*))、人肤蝇 (*Dermatobia hominis*)、果蝇属 (*Drosophila* spp.) (例如黑腹果蝇 (*Drosophila melanogaster*)、樱桃果蝇 (*Drosophila suzukii*))、稻象属 (*Echinocnemus* spp.)、*Euleia heraclei*、厕蝇属 (*Fannia* spp.)、胃蝇属 (*Gastrophilus* spp.)、舌蝇属 (*Glossina* spp.)、麻虻属 (*Haematopota* spp.)、毛眼水蝇属 (*Hydrellia* spp.)、大麦毛眼水蝇 (*Hydrellia griseola*)、黑蝇属 (*Hylemya* spp.)、虱蝇属 (*Hippobosca* spp.)、皮蝇属 (*Hypoderma* spp.)、斑潜蝇属 (*Liriomyza* spp.) (例如菜斑潜蝇 (*Liriomyza brassicae*)、南美斑潜蝇 (*Liriomyza huidobrensis*)、美洲斑潜蝇 (*Liriomyza sativae*))、绿蝇属 (*Lucilia* spp.) (例如铜绿蝇 (*Lucilia cuprina*))、罗蛉属 (*Lutzomyia* spp.)、曼蚊属 (*Mansonia* spp.)、家蝇属 (*Musca* spp.) (例如家蝇 (*Musca domestica*)、舍蝇 (*Musca domestica vicina*))、狂蝇属 (*Oestrus* spp.)、瑞典麦秆蝇 (*Oscinella frit*)、拟长跑摇蚊属 (*Paratanytarsus* spp.)、*Paralauterborniella subcincta*、泉蝇属 (*Pegomya* 或 *Pegomyia* spp.) (例如甜菜泉蝇 (*Pegomya betae*)、天仙子泉蝇 (*Pegomya hyoscyami*)、悬钩子泉蝇 (*Pegomya rubivora*))、白蛉属 (*Phlebotomus* spp.)、草种蝇属 (*Phorbia* spp.)、伏蝇属 (*Phormia* spp.)、酪蝇 (*Piophilus casei*)、*Platyparea poeciloptera*、*Prodiplosis* spp.、胡萝卜茎蝇 (*Psila rosae*)、绕实蝇属 (*Rhagoletis* spp.) (例如东部樱桃实蝇 (*Rhagoletis cingulata*)、核桃绕实蝇 (*Rhagoletis completa*)、黑樱桃实蝇 (*Rhagoletis fausta*)、西部樱桃实蝇 (*Rhagoletis indifferens*)、越桔实蝇 (*Rhagoletis mendax*)、苹果实蝇 (*Rhagoletis pomonella*))、麻蝇属 (*Sarcophaga* spp.)、蚋属 (*Simulium* spp.) (例如南方蚋 (*Simulium meridionale*))、螿蝇属 (*Stomoxys* spp.)、虻属 (*Tabanus* spp.)、根斑蝇属 (*Tetanops* spp.)、大蚊属 (*Tipula* spp.) (例如欧洲大蚊 (*Tipula paludosa*)、牧场大蚊 (*Tipula simplex*))、*Toxotrypana curvicauda*;

[0966] 半翅目 (Hemiptera) 的害虫, 例如 *Acizzia acaciaebaileyanae*、*Acizzia dodonaeae*、木虱 (*Acizzia uncatoides*)、长头蝗 (*Acrida turrata*)、无网长管蚜属 (*Acyrtosiphon* spp.) (例如豌豆长管蚜 (*Acyrtosiphon pisum*))、*Acrogonia* spp.、*Aeneolamia* spp.、隆脉木虱属 (*Agonosцена* spp.)、刺粉虱属 (*Aleurocanthus* spp.)、欧洲甘蓝粉虱 (*Aleyrodes proletella*)、蔗粉穴粉虱 (*Aleurolobus barodensis*)、棉粉虱 (*Aleurothrixus floccosus*)、植莲木虱 (*Allocaridara malayensis*)、芒果叶蝉属 (*Amrasca* spp.) (例如小绿叶蝉 (*Amrasca bigutulla*)、小叶蝉 (*Amrasca devastans*))、圆尾蚜 (*Anuraphis cardui*)、肾圆盾蚧属 (*Aonidiella* spp.) (例如红肾圆盾蚧 (*Aonidiella aurantii*)、黄肾圆盾蚧 (*Aonidiella citrina*)、苏铁肾盾蚧 (*Aonidiella inornata*))、梨瘤蚜 (*Aphanostigma piri*)、蚜属 (*Aphis* spp.) (例如绣线菊蚜 (*Aphis citricola*)、黑豆蚜 (*Aphis craccivora*)、甜菜蚜 (*Aphis fabae*)、草莓根蚜 (*Aphis forbesi*)、大豆蚜 (*Aphis*

glycines)、棉蚜(*Aphis gossypii*)、常春藤蚜(*Aphis hederæ*)、葡萄藤蚜(*Aphis illinoisensis*)、*Aphis middletoni*、鼠李马铃薯蚜(*Aphis nasturtii*)、夹竹桃蚜(*Aphis nerii*)、苹果蚜(*Aphis pomi*)、卷叶蚜(*Aphis spiraeicola*)、*Aphis viburniphila*)、葡萄叶蜂(*Arboridia apicalis*)、*Arytainilla* spp.、小圆盾蚧属(*Aspidiella* spp.)、圆盾蚧属(*Aspidiotus* spp.) (例如常春藤圆盾蚧(*Aspidiotus nerii*))、*Atanus* spp.、茄沟无网蚜(*Aulacorthum solani*)、烟粉虱(*Bemisia tabaci*)、澳大利亚木虱(*Blastopsylla occidentalis*)、*Boreioglycaspis melaleucæ*、李短尾蚜(*Brachycaudus helichrysi*)、微管姆属(*Brachycolus* spp.)、甘蓝蚜(*Brevicoryne brassicæ*)、喀木虱属(*Cacopsylla* spp.) (例如梨木虱(*Cacopsylla pyricola*))、小褐稻虱(*Calligypona marginata*)、*Capulinia* spp.、丽黄头大叶蝉(*Carneocephala fulgida*)、甘蔗绵蚜(*Ceratovacuna lanigera*)、沫蝉科(*Cercopidae*)、蜡蚧属(*Ceroplastes* spp.)、草莓钉蚜(*Chaetosiphon fragaefolii*)、蔗黄雪盾蚧(*Chionaspis tegalensis*)、茶绿叶蜂(*Chlorita onukii*)、台湾大蝗(*Chondracris rosea*)、核桃黑斑蚜(*Chromaphis juglandicola*)、黑褐圆盾蚧(*Chrysomphalus aonidum*)、黑褐圆盾蚧(*Chrysomphalus ficus*)、玉米叶蝉(*Cicadulina mbila*)、*Coccomytilus halli*、软蚧属(*Coccus* spp.) (例如褐软蚧(*Coccus hesperidum*)、长椭圆软蚧(*Coccus longulus*)、桔软蜡蚧(*Coccus pseudomagnoliarum*)、咖啡绿蚧(*Coccus viridis*))、隐瘤蚜(*Cryptomyzus ribis*)、*Cryptoneossa* spp.、梳木风属(*Ctenarytaina* spp.)、黄翅叶蝶属(*Dalbulus* spp.)、*Dialeurodes chittendeni*、柑橘粉虱(*Dialeurodes citri*)、柑橘木虱(*Diaphorina citri*)、白背盾蚧属(*Diaspis* spp.)、*Diuraphis* spp.、*Doralis* spp.、履绵蚧属(*Drosicha* spp.)、西圆尾蚜属(*Dysaphis* spp.) (例如锈条蚜(*Dysaphis apiifolia*)、车前草蚜(*Dysaphis plantaginea*)、百合西圆尾蚜(*Dysaphis tulipæ*))、灰粉蚧属(*Dysmicoccus* spp.)、小绿叶蝉属(*Empoasca* spp.) (例如西部马铃薯叶蝉(*Empoasca abrupta*)、蚕豆小叶蝉(*Empoasca fabæ*)、苹果小绿叶蝉(*Empoasca maligna*)、茄微叶蝉(*Empoasca solana*)、*Empoasca stevensi*)、绵蚜属(*Eriosoma* spp.) (例如美洲绵蚜(*Eriosoma americanum*)、苹果绵蚜(*Eriosoma lanigerum*)、梨根绵蚜(*Eriosoma pyricola*))、斑叶蝉属(*Erythroneura* spp.)、*Eucalyptolyma* spp.、褐木虱属(*Euphyllura* spp.)、殃叶蝉(*Euscelis bilobatus*)、拂粉阶属(*Ferrisia* spp.)、*Fiorinia* spp.、*Furcaspis oceanica*、咖啡地粉蚧(*Geococcus coffeæ*)、*Glycaspis* spp.、银合欢木虱(*Heteropsylla cubana*)、颊木虱(*Heteropsylla spinulosa*)、假桃病毒叶蝉(*Homalodisca coagulata*)、梅大尾蚜(*Hyalopterus arundinis*)、桃大尾蚜(*Hyalopterus pruni*)、吹绵蚧属(*Icerya* spp.) (例如吹绵蚧壳虫(*Icerya purchasi*))、*Idiocerus* spp.、扁喙叶蝉属(*Idioscopus* spp.)、灰飞虱(*Laodelphax striatellus*)、蜡蚧属(*Lecanium* spp.) (例如水土坚蚧(*Lecanium corni*) (= *Parthenolecanium corni*))、盾蚧属(*Lepidosaphes* spp.) (例如榆蚜盾蚧(*Lepidosaphes ulmi*))、萝卜蚜(*Lipaphis erysimi*)、日本长白蚧(*Lopholeucaspis japonica*)、斑衣蜡蝉(*Lycorma delicatula*)、长管蚜属(*Macrosiphum* spp.) (例如马铃薯长管蚜(*Macrosiphum euphorbiæ*)、百合长管蚜(*Macrosiphum lilii*)、蔷薇长管蚜(*Macrosiphum rosæ*))、二点叶蜂(*Macrosteles facifrons*)、沫蝶属(*Mahanarva* spp.)、高粱蚜(*Melanaphis sacchari*)、*Metcalfiella* spp.、*Metcalfa pruinosa*、麦无网蚜

(*Metopolophium dirhodum*)、黑缘平翅斑蚜(*Monellia costalis*)、*Monelliopsis pecanis*、瘤蚜属(*Myzus* spp.) (例如冬葱瘤蚜(*Myzus ascalonicus*)、梅瘤蚜(*Myzus cerasi*)、女贞瘤蚜(*Myzus ligustri*)、莖菜瘤蚜(*Myzus ornatus*)、桃蚜(*Myzus persicae*)、烟蚜(*Myzus nicotianae*))、莴苣衲长管蚜(*Nasonovia ribisnigri*)、*Neomaskellia* spp.、黑尾叶蝉属(*Nephotettix* spp.) (例如黑尾叶蝉(*Nephotettix cincticeps*)、二条黑尾叶蝉(*Nephotettix nigropictus*))、*Nettigonella spectra*、褐飞虱(*Nilaparvata lugens*)、*Oncometopia* spp.、*Orthezia praelonga*、中华稻蝗(*Oxya chinensis*)、*Pachypsylla* spp.、杨梅粉虱(*Parabemisia myricae*)、虱啮属(*Paratrioza* spp.) (例如马铃薯木虱(*Paratrioza cockerelli*))、片盾蚧属(*Parlatoria* spp.)、瘿绵蚜属(*Pemphigus* spp.) (例如囊柄瘿绵蚜(*Pemphigus bursarius*)、*Pemphigus populivivae*)、玉米蜡蝉(*Peregrinus maidis*)、*Perkinsiella* spp.、绵粉蚧属(*Phenacoccus* spp.) (例如美地绵粉蚧(*Phenacoccus madeirensis*))、杨平翅绵蚜(*Phloeomyzus passerinii*)、忽布疣蚜(*Phorodon humuli*)、葡萄根瘤蚜属(*Phylloxera* spp.) (例如*Phylloxera devastatrix*、警根瘤蚜(*Phylloxera notabilis*))、苏铁褐点并盾蚧(*Pinnaspis aspidistrae*)、臀纹粉蚧属(*Planococcus* spp.) (例如橘臀纹粉蚧(*Planococcus citri*))、*Prosopidopsylla flava*、梨形原绵腊蚧(*Protopulvinaria pyriformis*)、桑白盾蚧(*Pseudaulacaspis pentagona*)、粉蚧属(*Pseudococcus* spp.) (例如柑栖粉蚧(*Pseudococcus calceolariae*)、康氏粉蚧(*Pseudococcus comstocki*)、拟长尾粉蚧(*Pseudococcus longispinus*)、葡萄粉蚧(*Pseudococcus maritimus*)、暗色粉蚧(*Pseudococcus viburni*))、*Psyllopsis* spp.、木虱属(*Psylla* spp.) (例如黄杨木虱(*Psylla buxi*)、苹木虱(*Psylla mali*)、梨木虱(*Psylla pyri*))、金小蜂属(*Pteromalus* spp.)、桃绵蜡蚧(*Pulvinaria* spp.)、*Pyrilla* spp.、笠圆盾蚧属(*Quadraspidotus* spp.) (例如胡桃园盾蚧(*Quadraspidotus juglansregiae*)、杨笠圆盾蚧(*Quadraspidotus ostreaeformis*)、梨笠盾蚧(*Quadraspidotus perniciosus*))、*Quesada gigas*、平刺粉蚧属(*Rastrococcus* spp.)、缢管蚜属(*Rhopalosiphum* spp.) (例如玉米蚜(*Rhopalosiphum maidis*)、苹草缢管蚜(*Rhopalosiphum oxycanthae*)、稻麦蚜(*Rhopalosiphum padi*)、红腹缢管蚜(*Rhopalosiphum rufiabdominale*))、黑盔蚧属(*Saissetia* spp.) (例如咖啡黑盔蚧(*Saissetia coffeae*)、*Saissetia miranda*、*Saissetia neglecta*、黑蜡蚧(*Saissetia oleae*))、葡萄带叶蝉(*Scaphoideus titanus*)、麦二叉蚜(*Schizaphis graminum*)、苏铁刺圆盾蚧(*Selenaspis articulatus*)、*Sipha flava*、麦长管蚜(*Sitobion avenae*)、长唇基飞虱属(*Sogatata* spp.)、白背飞虱(*Sogatella furcifera*)、稻飞虱属(*Sogatodes* spp.)、*Stictocephala festina*、树粉虱(*Siphoninus phillyreae*)、*Tenalaphara malayensis*、*Tetragonocephala* spp.、长斑蚜属(*Tinocallis caryaefoliae*)、广胸沫蝉属(*Tomaspis* spp.)、声蚜属(*Toxoptera* spp.) (例如小桔蚜(*Toxoptera aurantii*)、大桔蚜(*Toxoptera citricidus*))、温室粉虱(*Trialeurodes vaporariorum*)、尖翅木虱属(*Trioza* spp.) (例如柿木虱(*Trioza diospyri*))、小叶蝉属(*Typhlocyba* spp.)、尖盾蚧属(*Unaspis* spp.)、葡萄根瘤蚜(*Viteus vitifolii*)、么叶蝉属(*Zygina* spp.);

[0967] 异翅目(*Heteroptera*)的害虫,例如,*Aelia* spp.、南瓜缘蝽(*Anasa tristis*)、拟丽蝽属(*Antestiopsis* spp.)、*Boisea* spp.、土长蝽属(*Blissus* spp.)、俊盲蝽属

(*Calocoris* spp.)、斑腿微刺盲蝽(*Campylomma livida*)、异背长蝽属(*Cavelerius* spp.)、臭虫属(*Cimex* spp.) (例如*Cimex adjunctus*、热带臭虫(*Cimex hemipterus*)、温带臭虫(*Cimex lectularius*)、蝠臭虫(*Cimex pilosellus*))、白瓣麦寄蝇属(*Collaria* spp.)、绿盲蝽(*Creontiades dilutus*)、胡椒缘蝽(*Dasynus piperis*)、*Dichelops furcatus*、厚氏长棒网蝽(*Diconocoris hewetti*)、棉红蝽属(*Dysdercus* spp.)、美洲蝽属(*Euschistus* spp.) (例如英雄美洲蝽(*Euschistus heros*)、褐美洲蝽(*Euschistus servus*)、三色美洲蝽(*Euschistus tristigma*)、三点美洲蝽(*Euschistus variolarius*))、菜蝽属(*Eurydema* spp.)、扁盾蝽属(*Eurygaster* spp.)、茶翅蝽(*Halyomorpha halys*)、盲蝽属(*Heliopeltis* spp.)、*Horcias nobilellus*、稻缘蝽属(*Leptocorisa* spp.)、异稻缘蝽(*Leptocorisa varicornis*)、西部喙缘蝽(*Leptoglossus occidentalis*)、叶缘缘蝽(*Leptoglossus phyllopus*)、丽盲蝽属(*Lygocoris* spp.) (例如原丽盲蝽(*Lygocoris pabulinus*))、草盲蝽属(*Lygus* spp.) (例如灰豆草盲蝽(*Lygus elisus*)、豆荚草盲蝽(*Lygus hesperus*)、美国牧草盲蝽(*Lygus lineolaris*))、蔗黑长蝽(*Macropes excavatus*)、*Megacopta cribraria*、*Miridae*、金光绿盲蝽(*Monalonion atratum*)、绿蝽属(*Nezara* spp.) (例如稻绿蝽(*Nezara viridula*))、*Nysius* spp、稻蝽属(*Oebalus* spp.)、*Pentomidae*、方背皮蝽(*Piesma quadrata*)、壁蝽属(*Piezodorus* spp.) (例如盖德拟壁蝽(*Piezodorus guildinii*))、盲蝽属(*Psallus* spp.)、*Pseudacysta perseae*、红猎蝽属(*Rhodnius* spp.)、可可褐盲蝽(*Sahlbergella singularis*)、*Scaptocoris castanea*、黑蝽属(*Scotinophora* spp.)、梨冠网蝽(*Stephanitis nashi*)、*Tibraca* spp.、锥猎蝽属(*Triatoma* spp.)；

[0968] 膜翅目(*Hymenoptera*)的害虫,例如,顶切叶蚁属(*Acromyrmex* spp.)、菜叶蜂属(*Athalia* spp.) (例如z.B.黄翅菜叶蜂(z.B.*Athalia rosae*))、美切叶蚁属(*Atta* spp.)、弓背蚁属(*Camponotus* spp.)、*Dolichovespula* spp.、松叶蜂属(*Diprion* spp.) (例如类欧松叶蜂(*Diprion similis*))、实叶蜂属(*Hoplocampa* spp.) (例如樱实叶蜂(*Hoplocampa cookei*)、苹叶蜂(*Hoplocampa testudinea*))、毛蚁属(*Lasius* spp.)、阿根廷蚁(*Linepithema (Iridomyrmex) humile*)、小家蚁(*Monomorium pharaonis*)、立毛蚁属(*Paratrechina* spp.)、*Paravespula* spp.、*Plagiolepis* spp.、树蜂属(*Sirex* spp.)、红火蚁(*Solenopsis invicta*)、臭蚁属(*Tapinoma* spp.)、白足狡臭蚁(*Technomyrmex albipes*)、大树蜂属(*Urocerus* spp.)、胡蜂属(*Vespa* spp.) (例如黄边胡蜂(*Vespa crabro*))、小火蚁(*Wasmannia auropunctata*)、黑树蜂属(*Xeris* spp.)；

[0969] 等足目(*Isopoda*)的害虫,例如,鼠妇(*Armadillidium vulgare*)、栉水虱(*Oniscus asellus*)、球鼠妇(*Porcellio scaber*)；

[0970] 等翅目(*Isoptera*)的害虫,例如,家白蚁属(*Coptotermes* spp.) (例如台湾乳白蚁(*Coptotermes formosanus*))、堆角白蚁(*Cornitermes cumulans*)、堆砂白蚁属(*Cryptotermes* spp.)、楹白蚁属(*Incisitermes* spp.)、木白蚁属(*Kaloterme* spp.)、稻麦小白蚁(*Microtermes obesi*)、鼻白蚁属(*Nasutitermes* spp.)、土白蚁属(*Odontotermes* spp.)、*Porotermes* spp.、散白蚁属(*Reticulitermes* spp.) (例如黄肢散白蚁(*Reticulitermes flavipes*)、美国散白蚁(*Reticulitermes hesperus*))；

[0971] 鳞翅目(*Lepidoptera*)的害虫,例如,小蜡螟(*Achroia grisella*)、桑剑纹夜蛾(*Acronicta major*)、褐带卷蛾属(*Adoxophyes* spp.) (例如棉褐带卷蛾(*Adoxophyes*

orana))、烦夜蛾(*Aedia leucomelas*)、地老虎属(*Agrotis* spp.) (例如黄地老虎(*Agrotis segetum*)、小地老虎(*Agrotis ipsilon*))、波纹夜蛾属(*Alabama* spp.) (例如棉叶波纹夜蛾(*Alabama argillacea*))、脐橙螟(*Amyelois transitella*)、条麦蛾属(*Anarsia* spp.)、干煞夜蛾属(*Anticarsia* spp.) (例如大豆夜蛾(*Anticarsia gemmatalis*))、条小卷蛾属(*Argyroploce* spp.)、苜蓿银纹夜蛾属(*Autographa* spp.)、甘蓝夜蛾(*Barathra brassicae*)、苹髓尖蛾(*Blastodacna atra*)、粘弄蝶(*Borbo cinnara*)、棉潜蛾(*Bucculatrix thurberiella*)、松尺蠖(*Bupalus piniarius*)、蛀褐夜蛾属(*Busseola* spp.)、卷叶蛾属(*Cacoecia* spp.)、茶细蛾(*Caloptilia theivora*)、烟卷蛾(*Capua reticulana*)、苹果小卷蛾(*Carpocapsa pomonella*)、桃蛀果蛾(*Carposina niponensis*)、冬尺蛾(*Cheimatobia brumata*)、禾草螟属(*Chilo* spp.) (例如Chilo plejadellus、二化螟(*Chilo suppressalis*))、*Choreutis pariana*、色卷蛾属(*Choristoneura* spp.)、*Chrysodeixis chalcites*、葡萄果蠹蛾(*Clysia ambiguella*)、纵卷叶野螟属(*Cnaphalocerus* spp.)、稻纵卷叶野螟(*Cnaphalocrocis medinalis*)、云卷蛾属(*Cnephasia* spp.)、茶枝尖细蛾属(*Conopomorpha* spp.)、球颈象属(*Conotrachelus* spp.)、*Copitarsia* spp.、小卷蛾属(*Cydia* spp.) (例如豆荚小卷蛾(*Cydia nigricana*)、苹果蠹蛾(*Cydia pomonella*))、*Dalaca noctuides*、绢野螟属(*Diaphania* spp.)、*Diparopsis* spp.、小蔗秆草螟(*Diatraea saccharalis*)、钻夜蛾属(*Earias* spp.)、*Ecdytolopha aurantium*、南美玉米苗斑螟(*Elasmopalpus lignosellus*)、甘薯秆螟(*Eldana saccharina*)、粉斑螟属(*Epehstia* spp.) (例如烟草粉斑螟(*Epehstia elutella*)、地中海斑螟(*Epehstia kuehniella*))、叶小卷蛾属(*Epinotia* spp.)、苹淡褐卷蛾(*Epiphyas postvittana*)、*Erannis* spp.、亚洲胡桃蛾(*Erschoviella musculana*)、荚斑螟属(*Etiella* spp.)、*Eudocima* spp.、棕卷蛾属(*Eulia* spp.)、女贞细卷蛾(*Eupoecilia ambiguella*)、毒蛾属(*Euproctis* spp.) (例如黄毒蛾(*Euproctis chrysorrhoea*))、切夜蛾属(*Euxoa* spp.)、脏切夜蛾属(*Feltia* spp.)、大蜡螟(*Galleria mellonella*)、细蛾属(*Gracillaria* spp.)、小食心虫属(*Grapholitha* spp.) (例如梨小食心虫(*Grapholitha molesta*)、杏小食心虫(*Grapholitha prunivora*))、甘蔗螟属(*Hedylepta* spp.)、铃夜蛾属(*Helicoverpa* spp.) (例如棉铃虫(*Helicoverpa armigera*)、玉米夜蛾(*Helicoverpa zea*))、实夜蛾属(*Heliothis* spp.) (例如烟芽夜蛾(*Heliothis virescens*))、褐织蛾(*Hofmannophila pseudospretella*)、同斑螟属(*Homoeosoma* spp.)、长卷蛾属(*Homona* spp.)、苹果巢蛾(*Hyponomeuta padella*)、柿举枝蛾(*Kakivoria flavofasciata*)、亮灰蝶属(*Lampides* spp.)、贪夜蛾属(*Laphygma* spp.)、蠹食心虫(*Laspeyresia molesta*)、茄白翅野螟(*Leucinodes orbonalis*)、纹潜蛾属(*Leucoptera* spp.) (例如咖啡潜叶蛾(*Leucoptera coffeella*))、潜叶细蛾属(*Lithocolletis* spp.) (例如苹果斑幕潜叶蛾(*Lithocolletis blancardella*))、绿果冬夜蛾(*Lithophane antennata*)、花翅小蛾属(*Lobesia* spp.) (例如葡萄花翅小卷蛾(*Lobesia botrana*))、豆白隆切根虫(*Loxagrotis albicosta*)、毒蛾属(*Lymantria* spp.) (例如舞毒蛾(*Lymantria dispar*))、潜蛾属(*Lyonetia* spp.) (例如桃潜叶蛾(*Lyonetia clerkella*))、黄褐天幕毛虫(*Malacosoma neustria*)、豆荚野螟(*Maruca testulalis*)、甘蓝夜蛾(*Mamstra brassicae*)、稻暮眼蝶(*Melanitis leda*)、毛胫夜蛾属(*Mocis* spp.)、*Monopis obviella*、粘虫(*Mythimna separata*)、橡长角蛾(*Nemapogon*

cloacellus)、水螟属(*Nymphula* spp.)、*Oiketicus* spp.、楸属(*Omphisa* spp.)、*Operophtera* spp.、麦秆夜蛾属(*Oria* spp.)、瘤丛螟属(*Orthaga* spp.)、秆野螟属(*Ostrinia* spp.) (例如欧洲玉米螟(*Ostrinia nubilalis*))、小眼夜蛾(*Panolis flammea*)、稻弄蝶属(*Parnara* spp.)、红铃虫属(*Pectinophora* spp.) (例如棉红铃虫(*Pectinophora gossypiella*))、潜跳甲属(*Perileucoptera* spp.)、茄麦蛾属(*Phthorimaea* spp.) (例如马铃薯麦蛾(*Phthorimaea operculella*))、桔潜蛾(*Phyllocnistis citrella*)、小潜细蛾属(*Phyllonorycter* spp.) (例如金纹小潜细蛾(*Phyllonorycter blancardella*)、山楂潜叶蛾(*Phyllonorycter crataegella*))、粉蝶属(*Pieris* spp.) (例如菜粉蝶(*Pieris rapae*))、荷兰石竹小卷蛾(*Platynota stultana*)、印度谷斑螟(*Plodia interpunctella*)、金翅夜蛾属(*Plusia* spp.)、菜蛾(*Plutella xylostella*) (= 钻石背蛾(*Plutella maculipennis*))、小白巢蛾属(*Prays* spp.)、斜纹夜蛾属(*Prodenia* spp.)、烟草天蛾属(*Protoparce* spp.)、粘虫属(*Pseudaletia* spp.) (例如一星粘虫(*Pseudaletia unipuncta*))、大豆尺夜蛾(*Pseudoplusia includens*)、玉米螟(*Pyrausta nubilalis*)、薄荷灰夜蛾(*Rachiplusia* nu)、禾螟属(*Schoenobius* spp.) (例如三化螟(*Schoenobius bipunctifer*))、白禾螟属(*Scirpophaga* spp.) (例如稻白螟(*Scirpophaga innotata*))、黄地老虎(*Scotia segetum*)、茎夜蛾属(*Sesamia* spp.) (例如大螟(*Sesamia inferens*))、长须卷蛾属(*Sparganothis* spp.)、灰翅夜蛾属(*Spodoptera* spp.) (例如*Spodoptera eradiana*、甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua*)、草地贪夜蛾(*Spodoptera frugiperda*)、*Spodoptera praefica*)、展足蛾属(*Stathmopoda* spp.)、*Stenoma* spp.、花生麦蛾(*Stomopteryx subsecivella*)、透翅蛾属(*Synanthedon* spp.)、安第斯马铃薯块茎蛾(*Tecia solanivora*)、异舟蛾属(*Thaumetopoea* spp.)、大豆夜蛾(*Thermesia gemmatilis*)、木塞谷蛾(*Tinea cloacella*)、袋谷蛾(*Tinea pellionella*)、幕谷蛾(*Tineola bisselliella*)、卷蛾属(*Tortrix* spp.)、毛毡衣蛾(*Trichophaga tapetzella*)、粉夜蛾属(*Trichoplusia* spp.) (例如粉纹夜蛾(*Trichoplusia ni*))、三化螟(*Tryporyza incertulas*)、番茄斑潜蝇(*Tuta absoluta*)、灰蝶属(*Virachola* spp.);

[0972] 直翅目(*Orthoptera*)或跳跃目(*Saltatoria*)的害虫,例如,家蟋蟀(*Acheta domesticus*)、*Dichroplus* spp.、蝼蛄属(*Gryllotalpa* spp.) (例如欧洲蝼蛄(*Gryllotalpa gryllotalpa*))、蔗蝗属(*Hieroglyphus* spp.)、飞蝗属(*Locusta* spp.) (例如飞蝗(*Locusta migratoria*))、黑蝗属(*Melanoplus* spp.) (例如迁飞黑蝗(*Melanoplus devastator*)、*Paratlanticus ussuriensis*)、沙漠蝗(*Schistocerca gregaria*);

[0973] 虱目(*Phthiraptera*)的害虫,例如,例如畜虱属(*Damalinia* spp.)、血虱属(*Haematopinus* spp.)、毛虱属(*Linognathus* spp.)、虱属(*Pediculus* spp.)、根瘤蚜(*Phylloxera vastatrix*)、阴虱(*Ptirus pubis*)、啮毛虱属(*Trichodectes* spp.);

[0974] 啮虫目(*Psocoptera*)的害虫,例如,粉啮虫属(*Lepinatus* spp.)、书虱属(*Liposcelis* spp.);

[0975] 蚤目(*Siphonaptera*)的害虫,例如,角叶蚤属(*Ceratophyllus* spp.)、栉首蚤属(*Ctenocephalides* spp.) (例如犬栉头蚤(*Ctenocephalides canis*)、猫栉首蚤(*Ctenocephalides felis*))、跳蚤(*Pulex irritans*)、穿皮潜蚤(*Tunga penetrans*)、印鼠客蚤(*Xenopsylla cheopis*);

[0976] 缨翅目 (Thysanoptera) 的害虫, 例如, 玉米黄呆蓟马 (*Anaphothrips obscurus*)、稻蓟马 (*Baliothrips biformis*)、*Chaetanaphothrips leeuweni*、葡萄镰蓟马 (*Drepanothrips reuteri*)、*Enneothrips flavens*、花蓟马属 (*Frankliniella* spp.) (例如烟褐蓟马 (*Frankliniella fusca*)、西花蓟马 (*Frankliniella occidentalis*)、苏花蓟马 (*Frankliniella schultzei*)、麦花蓟马 (*Frankliniella tritici*)、越桔花蓟马 (*Frankliniella vaccinii*)、威廉期花蓟马 (*Frankliniella williamsi*)、蓟马属 (*Haplothrips* spp.)、阳蓟马属 (*Heliothrips* spp.)、温室条篱蓟马 (*Hercinothrips femoralis*)、卡蓟马属 (*Kakothrips* spp.)、葡萄蓟马 (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、硬蓟马属 (*Scirtothrips* spp.)、小豆蓴带蓟马 (*Taeniothrips cardamomi*)、蓟马属 (*Thrips* spp.) (例如棕榈蓟马 (*Thrips palmi*)、烟蓟马 (*Thrips tabaci*));

[0977] 衣鱼目 (*Zygentoma*) (= 缨尾亚目 (*Thysanura*)) 的害虫, 例如, 栉衣鱼属 (*Ctenolepisma* spp.)、衣鱼 (*Lepisma saccharina*)、盗火虫 (*Lepismodes inquilinus*)、家衣鱼 (*Thermobia domestica*);

[0978] 综合纲 (*Symphyla*) 的害虫, 例如, 么蚰属 (*Scutigera* spp.) (例如无斑点么蚰 (*Scutigera immaculata*));

[0979] 软体动物门 (*Mollusca*) 的害虫, 特别是双壳纲 (*Bivalvia*) 的害虫, 如饰贝属 (*Dreissena* spp.),

[0980] 以及腹足纲 (*Gastropoda*) 的害虫, 如阿勇蛞蝓属 (*Arion* spp.) (例如黑红阿勇蛞蝓 (*Arion ater rufus*))、双脐螺属 (*Biomphalaria* spp.)、小泡螺属 (*Bulinus* spp.)、野蛞蝓属 (*Deroceras* spp.) (例如田灰蛞蝓 (*Deroceras laeve*))、土蜗属 (*Galba* spp.)、椎实螺属 (*Lymnaea* spp.)、钉螺属 (*Oncomelania* spp.)、福寿螺属 (*Pomacea* spp.)、琥珀螺属 (*Succinea* spp.);

[0981] 扁形动物门 (*Platyhelminthes*) 和线虫纲 (*Nematoda*) 的动物寄生虫和人寄生虫, 例如猫圆线虫属 (*Aelurostrongylus* spp.)、裂口线虫属 (*Amidostomum* spp.)、钩口线虫属 (*Ancylostoma* spp.) (例如十二指肠钩虫 (*Ancylostoma duodenale*)、锡兰钩虫 (*Ancylostoma ceylanicum*)、巴西钩口线虫 (*Ancylostoma braziliensis*))、管圆线虫属 (*Angiostrongylus* spp.)、异尖属 (*Anisakis* spp.)、裸头绦虫属 (*Anoplocephala* spp.)、蛔虫属 (*Ascaris* spp.)、鸡蛔虫属 (*Ascaridia* spp.)、贝利蛔线虫属 (*Baylisascaris* spp.)、布鲁丝虫属 (*Brugia* spp.) (例如马来丝虫 (*Brugia malayi*)、帝汶布鲁丝虫 (*Brugia timori*))、仰口线虫属 (*Bunostomum* spp.)、毛细线虫属 (*Capillaria* spp.)、夏柏特线虫属 (*Chabertia* spp.)、支睾吸虫属 (*Clonorchis* spp.)、古柏线虫属 (*Cooperia* spp.)、环体线虫属 (*Crenosoma* spp.)、*Cyathostoma* spp.、双腔吸虫属 (*Dicrocoelium* spp.)、网尾线虫属 (*Dictyocaulus* spp.) (例如丝圆线虫 (*Dictyocaulus filaria*))、裂头属 (*Diphyllobothrium* spp.) (例如阔节裂头绦虫 (*Diphyllobothrium latum*))、复孔绦虫属 (*Dipylidium* spp.)、恶丝虫属 (*Dirofilaria* spp.)、龙线虫属 (*Dracunculus* spp.) (例如麦地那龙线虫 (*Dracunculus medinensis*))、棘球属 (*Echinococcus* spp.) (例如细粒棘球绦虫 (*Echinococcus granulosus*)、多房棘球绦虫 (*Echinococcus multilocularis*))、棘口吸虫属 (*Echinostoma* spp.)、蛲虫属 (*Enterobius* spp.) (例如蠕形住肠蛲虫 (*Enterobius vermicularis*))、*Eucoleus* spp.、片形属 (*Fasciola* spp.)、片吸虫属 (*Fascioloides*

spp.)、姜片属(*Fasciolopsis* spp.)、类丝虫属(*Filaroides* spp.)、筒线属(*Gongylonema* spp.)、筒线属(*Gyrodactylus* spp.)、丽线虫属(*Habronema* spp.)、血矛线虫属(*Haemonchus* spp.)、*Heligmosomoides* spp.、异刺线虫属(*Heterakis* spp.)、膜壳绦虫属(*Hymenolepis* spp.) (例如短膜壳绦虫(*Hymenolepis nana*))、猪圆形属(*Hyostrogylus* spp.)、光丝虫属(*Litomosoides* spp.)、罗阿丝虫属(*Loa* spp.) (例如罗阿丝虫(*Loa loa*))、后圆线虫属(*Metastrongylus* spp.)、次睾吸虫属(*Metorchis* spp.)、中殖孔绦虫属(*Mesocestoides* spp.)、蒙尼茨绦虫属(*Moniezia* spp.)、缪勒线虫(*Muellerius* spp.)、板口线虫属(*Necator* spp.)、细颈线虫属(*Nematodirus* spp.)、日本圆线虫属(*Nippostrongylus* spp.)、结节线虫属(*Oesophagostomum* spp.)、沃鲁线虫属(*Ollulanus* spp.)、盘尾丝虫属(*Onchocerca* spp) (例如旋盘尾丝虫(*Onchocerca volvulus*))、后睾属(*Opisthorchis* spp.)、*Oslerus* spp.、胃线虫属(*Ostertagia* spp.)、尖尾线虫属(*Oxyuris* spp.)、*Paracapillaria* spp.、尖尾线虫属(*Parafilaria* spp.)、并殖吸虫属(*Paragonimus* spp.)、同端盘属(*Paramphistomum* spp.)、副裸头绦虫属(*Paranoplocephala* spp.)、副蛔虫属(*Parascaris* spp.)、栓尾线虫属(*Passalurus* spp.)、原圆线虫属(*Protostrongylus* spp.)、血吸虫属(*Schistosoma* spp.)、腹腔丝虫属(*Setaria* spp.)、旋毛线虫属(*Spirocerca* spp.)、冠丝虫属(*Stephanofilaria* spp.)、冠尾线属(*Stephanurus* spp.)、类圆线虫属(*Strongyloides* spp.) (例如费氏类圆线虫(*Strongyloides fuelleborni*)、粪类圆线虫(*Strongyloides stercoralis*))、类圆线虫属(*Strongylus* spp.)、鸡张口丝虫属(*Syngamus* spp.)、绦虫属(*Taenia* spp.) (例如无钩绦虫(*Taenia saginata*)、猪肉绦虫(*Taenia solium*))、背带线虫属(*Teladorsagia* spp.)、吸吮线虫属(*Thelazia* spp.)、弓蛔线虫属(*Toxascaris* spp.)、弓蛔虫属(*Toxocara* spp.)、毛线虫属(*Trichinella* spp.) (例如旋毛线虫(*Trichinella spiralis*)、本地毛形线虫(*Trichinella native*)、布氏旋毛虫(*Trichinella britovi*)、南方旋毛虫(*Trichinella nelsoni*)、假旋毛形线虫(*Trichinella pseudospiralis*))、毛毕吸虫属(*Trichobilharzia* spp.)、毛圆线虫属(*Trichostrongylus* spp.)、鞭虫属(*Trichuris* spp.) (例如毛首鞭虫(*Trichuris trichuria*))、钩虫属(*Uncinaria* spp.)、吴策线虫属(*Wuchereria* spp.) (例如班氏吴策线虫(*Wuchereria bancrofti*));

[0982] 线虫纲(*Nematoda*)的植物害虫,即植物寄生线虫,尤其是野外垫刃线虫属(*Aglenchus* spp.) (例如居农野外垫刃线虫(*Aglenchus agricola*))、粒线虫属(*Anguina* spp.) (例如小麦粒线虫(*Anguina tritici*))、滑刃线虫属(*Aphelenchoides* spp.) (例如花生滑刃线虫(*Aphelenchoides arachidis*)、草莓滑刃线虫(*Aphelenchoides fragariae*))、刺线虫属(*Belonolaimus* spp.) (例如细小刺线虫(*Belonolaimus gracilis*)、长尾刺线虫(*Belonolaimus longicaudatus*)、诺顿刺线虫(*Belonolaimus nortoni*))、伞滑刃线虫属(*Bursaphelenchus* spp.) (例如椰子红环腐线虫(*Bursaphelenchus cocophilus*)、荒漠伞滑刃线虫(*Bursaphelenchus eremus*)、松材线虫(*Bursaphelenchus xylophilus*))、坏死线虫属(*Cacopaurus* spp.) (例如瘟疫坏死线虫(*Cacopaurus pestis*))、小环线虫属(*Criconemella* spp.) (例如弯曲小环线虫(*Criconemella curvata*)、刻线小环线虫(*Criconemella onoensis*)、装饰小环线虫(*Criconemella ornata*)、畸形小环线虫(*Criconemella rusium*)、薄叶小环线虫(*Criconemella xenoplax*(=环腐线虫

(*Mesocriconema xenoplax*)))、轮线虫属(*Criconemoides* spp.) (例如*Criconemoides ferniae*、*Criconemoides onoense*、*Criconemoides ornatum*)、双垫刃属(*Ditylenchus* spp.) (例如续断双垫刃线虫(*Ditylenchus dipsaci*))、锥线虫属(*Dolichodorus* spp.)、球异皮线虫属(*Globodera* spp.) (例如马铃薯白线虫(*Globodera pallida*)、马铃薯金线虫(*Globodera rostochiensis*))、螺旋线虫属(*Helicotylenchus* spp.) (例如双宫螺旋线虫(*Helicotylenchus dihystra*))、半轮线虫属(*Hemicriconemoides* spp.)、鞘线虫属(*Hemicycliophora* spp.)、异皮线虫属(*Heterodera* spp.) (例如燕麦胞囊线虫(*Heterodera avenae*)、大豆胞囊线虫(*Heterodera glycines*)、甜菜胞囊线虫(*Heterodera schachtii*))、*Hirschmaniella* spp.、纽带线虫属(*Hoplolaimus* spp.)、长针线虫属(*Longidorus* spp.) (例如非洲长针线虫(*Longidorus africanus*))、根结线虫属(*Meloidogyne* spp.) (例如哥伦比亚根结线虫(*Meloidogyne chitwoodi*)、伪根结线虫(*Meloidogyne fallax*)、北方根结线虫(*Meloidogyne hapla*)、南方根结线虫(*Meloidogyne incognita*))、瓢线虫属(*Meloinema* spp.)、珍珠线虫属(*Nacobbus* spp.)、拟茎线虫属(*Neotylenchus* spp.)、拟长针线虫属(*Paralongidorus* spp.)、拟滑刃线虫属(*Paraphelenchus* spp.)、拟毛刺线虫属(*Paratrichodorus* spp.) (例如次拟毛刺线虫(*Paratrichodorus minor*))、针线虫属(*Paratylenchus* spp.)、短体线虫属(*Pratylenchus* spp.) (例如穿刺短体线虫(*Pratylenchus penetrans*))、*Pseudohalenchus* spp.、平滑垫刃属(*Psilenchus* spp.)、斑皮胞囊线虫属(*Punctodera* spp.)、五沟线虫属(*Quinisulcius* spp.)、穿孔线虫属(*Radopholus* spp.) (例如柑桔穿孔线虫(*Radopholus citrophilus*)、香蕉穿孔线虫(*Radopholus similis*))、肾状线虫属(*Rotylenchulus* spp.)、盘旋线虫属(*Rotylenchus* spp.)、盾线虫属(*Scutellonema* spp.)、亚蛇形线虫属(*Subanguina* spp.)、毛刺线虫属(*Trichodorus* spp.) (例如短粗根毛刺线虫(*Trichodorus obtusus*)、原始毛刺线虫(*Trichodorus primitivus*))、矮化线虫属(*Tylenchorhynchus* spp.) (例如饰环矮化线虫(*Tylenchorhynchus annulatus*))、麦线虫属(*Tylenchulus* spp.) (例如柑桔根线虫(*Tylenchulus semipenetrans*))、剑线虫属(*Xiphinema* spp.) (例如标准剑线虫(*Xiphinema index*));

[0983] 此外,还可防治原生动物(Protozoa)亚门、球虫目(Coccidia)的害虫,例如艾美球虫属(*Eimeria* spp.)。

[0984] 在一定的浓度和施用率下,式(I)的化合物还可任选地用作除草剂、安全剂、生长调节剂或改善植物特性的试剂,用作杀微生物剂和杀配子剂,例如用作杀真菌剂、抗霉菌剂、杀细菌剂、杀病毒剂(包括抗类病毒试剂)或用作抵抗MLO(类支原体生物)和RLO(类立克次氏体生物)的试剂。如果合适,其还可以用作合成其他活性化合物的中间体或前体。

[0985] 制剂

[0986] 本发明还涉及包含至少一种式(I)的化合物的制剂和由其制备的作为农药的使用形式,例如浇灌、滴注和喷洒液体。任选地,使用形式还包含其他农药和/或具有改善作用的佐剂如渗透剂,例如植物油(如油菜籽油、向日葵油)、矿物油(如石蜡油)、植物脂肪酸的烷基酯(如油菜籽油甲酯或大豆油甲酯)、或烷醇烷氧基化物;和/或展着剂(spreader),例如烷基硅氧烷和/或盐(如有机或无机铵盐或磷盐,例如硫酸铵或磷酸氢二铵);和/或保留促进剂,例如磺基丁二酸二辛酯或羟丙基瓜尔胶聚合物;和/或湿润剂,例如甘油;和/或肥料,

例如含铵、含钾或含磷的肥料。

[0987] 常规的制剂为,例如水溶性液体剂(SL)、乳液浓缩剂(EC)、水包乳剂(EW)、悬浮浓缩剂(SC、SE、FS、OD)、水分散性颗粒剂(WG)、颗粒剂(GR)和胶囊浓缩剂(CS);这些制剂和其他可能的制剂类型例如被国际作物生命组织(Crop Life International)记载并在以下文献中描述:《农药说明书》、《联合国粮农组织和世界卫生组织农药说明书开发与使用手册》、《联合国粮农组织植物生产与保护文献-173》(由联合国粮农组织(FAO)/世界卫生组织(WHO)关于农药手册的联合会议制订,2004,ISBN:9251048576)。除了一种或多种式(I)的化合物外,所述制剂还任选地包含其他农用化学活性化合物。

[0988] 优选的是包含下述物质的制剂或使用形式:助剂,如增量剂、溶剂、自发性促进剂、载体、乳化剂、分散剂、防冻剂、杀生物剂(biocide)、增稠剂;和或其他助剂,如佐剂。在本发明的上下文中,佐剂是增强制剂的生物功效的组分,而该组分本身不具有任何生物功效。佐剂的实例为促进保留、铺展、附着到叶面或渗透的试剂。

[0989] 这些制剂以已知方式制备,例如通过将式(I)的化合物与助剂如增量剂、溶剂和/或固体载体和/或其他助剂如表面活性剂相混合。所述制剂在合适的设备中制备或在施用前或施用过程中制备。

[0990] 所使用的助剂可为适合用于向式(I)的化合物的制剂或由这些制剂制备的使用形式(如即用型(ready-to-use)农药,如喷洒液体或拌种剂产品)赋予特定特性(例如特定的物理、技术和/或生物特性)的物质。

[0991] 合适的增量剂例如水、极性和非极性有机化学液体,例如选自:芳族烃和非芳族烃(如石蜡、烷基苯、烷基萘、氯苯)、醇和多元醇(如果合适的话,其还可被取代、醚化和/或酯化)、酮(如丙酮、环己酮)、酯(包括脂肪和油)和(聚)醚、简单的胺和取代的胺、酰胺、内酰胺(如N-烷基吡咯烷酮)和内酯、砜和亚砜(如二甲基亚砜)。

[0992] 如果所用的增量剂是水,则还可使用例如有机溶剂作为助溶剂。有用的液体溶剂主要为:芳族化合物,如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯代芳族烃和氯代脂肪族烃,如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,如环己烷或石蜡,如矿物油馏分、矿物油和植物油;醇,如丁醇或乙二醇及其醚和酯;酮,如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂,如二甲基甲酰胺和二甲基亚砜;以及水。

[0993] 原则上,可使用所有合适的溶剂。合适的溶剂的实例为:芳族烃,如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯化的芳族烃或脂肪族烃,如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,如环己烷、石蜡、矿物油馏分、矿物油和植物油;醇,如甲醇、乙醇、异丙醇、丁醇或乙二醇及其醚和酯;酮,如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂,如二甲基亚砜;以及水。

[0994] 原则上,可使用所有合适的载体。有用的载体尤其包括:例如,铵盐和磨碎的天然矿物,如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、绿坡缕石、蒙脱石或硅藻土;和磨碎的合成矿物质,如细碎的二氧化硅、氧化铝和天然或合成的硅酸盐、树脂、蜡和/或固体肥料。同样可使用这些载体的混合物。用于颗粒剂的有用载体包括:例如,压碎并分级的天然岩石,如方解石、大理石、浮石、海泡石、白云石;以及无机和有机粉的合成颗粒;以及有机材料的颗粒,如锯屑、纸、椰壳、玉米穗轴和烟草茎。

[0995] 还可使用液化的气体增量剂或溶剂。特别合适的是在标准温度和大气压下为气态的那些增量剂或载体,例如,气溶胶喷射剂(aerosol propellant),如卤代烃,以及丁烷、丙

烷、氮气和二氧化碳。

[0996] 具有离子或非离子性质的乳化剂和/或发泡剂、分散剂或润湿剂、或这些表面活性物质的混合物的实例为：聚丙烯酸的盐；木素磺酸的盐；苯酚磺酸或萘磺酸的盐；环氧乙烷与脂肪醇或与脂肪酸或与脂肪胺的缩聚物、环氧乙烷与取代的酚（优选烷基酚或芳基酚）的缩聚物；磺基丁二酸酯的盐；牛磺酸衍生物（优选牛磺酸烷基酯）；聚乙氧基化醇或酚的磷酸酯；多元醇的脂肪酸酯；以及含硫酸根、磺酸根和磷酸根的化合物的衍生物，例如烷基芳基聚乙二醇醚、烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、芳基磺酸盐、蛋白质水解产物、木质素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。如果式(I)的化合物之一和/或惰性载体之一不溶于水并且当施用在水中进行时，则表面活性剂的存在是有利的。

[0997] 可存在于制剂和源自其的使用形式中的其他助剂为：染料，例如无机颜料，如氧化铁、氧化钛、普鲁士蓝；和有机染料，如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料；以及营养物和微量营养物，如铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

[0998] 其他可以存在的组分为稳定剂，如低温稳定剂、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂或其他提高化学和/或物理稳定性的试剂。还可存在发泡剂和消泡剂。

[0999] 此外，制剂和源自其的使用形式还可包含下述物质作为其他的助剂：粘着剂，如羧甲基纤维素；以及粉末、颗粒、乳胶形式的天然和合成聚合物，如阿拉伯树胶、聚乙烯醇和聚乙烯乙酸酯；或者天然磷脂，如脑磷脂、卵磷脂和合成磷脂。其他助剂可以为矿物油和植物油。

[1000] 如果合适的话，其他助剂也可以存在于所述制剂和源自其的使用形式中。这些添加剂的实例为香料、保护胶体、粘合剂(binder)、胶粘剂(adhesive)、增稠剂、触变剂、渗透剂、保留促进剂、稳定剂、螯合剂、络合剂、湿润剂和展着剂。一般而言，式(I)的化合物可与通常用于制剂目的的任何固体或液体添加剂相结合。

[1001] 有用的保留促进剂包括所有那些降低动态表面张力的物质，如磺基丁二酸二辛酯；或增加粘弹性的物质，如羟丙基瓜尔胶聚合物。

[1002] 在本发明的上下文中，合适的渗透剂为所有那些通常用于增强农业化学活性化合物向植物内渗透的物质。在本发明的上下文中，渗透剂通过这样的方式定义：它们由（通常水性）施用液体和/或由喷洒涂层渗透到植物的表皮，从而增加活性化合物在表皮中的移动性的能力。文献(Baur等人,1997,Pesticide Science 51,131-152)中记载的方法可用于测定这种特性。实例包括：醇烷氧基化物，如椰子脂肪乙氧基化物(10)或异十三烷基乙氧基化物(12)；脂肪酸酯，如菜籽油甲酯或大豆油甲酯；脂肪胺烷氧基化物，如牛油胺乙氧基化物(15)；或铵盐和/或磷盐，如硫酸铵或磷酸氢二铵。

[1003] 所述制剂优选包含0.00000001重量%至98重量%的式(I)的化合物，更优选0.01重量%至95重量%的式(I)的化合物，最优选0.5重量%至90重量%的式(I)的化合物，基于所述制剂的重量计。

[1004] 在由制剂（尤其是农药）制备的使用形式中的式(I)的化合物的含量可在宽泛的范围内变化。在使用形式中的式(I)的化合物的浓度通常可为0.00000001重量%至95重量%的式(I)的化合物，优选为0.00001重量%至1重量%，基于使用形式的重量计。施用以适合于使用形式的常规方式进行。

[1005] 混合物

[1006] 式(I)的化合物还可以与下述一种或多种合适的如下物质的混合物的形式使用:杀真菌剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀软体动物剂、杀线虫剂、杀虫剂、微生物剂、有益生物、除草剂、肥料、鸟驱散剂、植物增强剂(phytotonic)、止繁殖剂、安全剂、化学信息素和/或植物生长调节剂,从而例如拓宽作用谱、延长作用周期、提高作用速率、防止排斥或防止抗性发展。另外,这类活性化合物结合物可以改善植物生长和/或对非生物因素的耐受性,如对高温或低温、对干旱或对高水含量或土壤盐度的耐受性。还可能改善开花和结果性能、优化发芽能力和根系发育、促进采收和提高产量、影响熟化、改善采收产品的品质和/或营养价值、延长储存期和/或改善采收产品的加工性能。

[1007] 此外,式(I)的化合物可以与其他活性化合物或化学信息素如引诱剂和/或鸟驱散剂和/或植物活化剂和/或生长调节剂和/或肥料的混合物形式存在。同样地,式(I)的化合物可以与用于改善植物性能如采收材料的生长、产量和品质的试剂的混合物形式使用。

[1008] 在本发明的一个特别的实施方案中,式(I)的化合物以与其他化合物(优选下文所述的化合物)的混合物的制剂的形式或由这些制剂制备的使用形式存在。

[1009] 如果下文提到的化合物之一可以不同互变异构形式存在,则这些形式即使在各种情况下没有被明确提及,同样也包括在内。

[1010] 杀虫剂/杀螨剂/杀线虫剂

[1011] 本文中以其“通用名称”所指定的活性成份是已知的,并且记载于例如农药手册(“The Pesticide Manual”,第16版,British Crop Protection Council 2012)中,或者可以在互联网(例如<http://www.alanwood.net/pesticides>)上检索到。

[1012] (1)乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂,例如氨基甲酸酯类,例如棉铃威(alanycarb)、涕灭威(aldicarb)、噁虫威(bendiocarb)、丙硫克百威(benfuracarb)、丁酮威(butocarboxim)、丁酮砜威(butoxycarboxim)、胺甲萘(carbaryl)、卡巴呋喃(carbofuran)、丁硫克百威(carbosulphan)、乙硫苯威(ethiofencarb)、仲丁威(fenobucarb)、伐虫脒(formetanate)、呋线威(furathiocarb)、异丙威(isoprocarb)、灭虫威(methiocarb)、灭多威(methomyl)、速灭威(metolcarb)、杀线威(oxamyl)、抗蚜威(pirimicarb)、残杀威(propoxur)、硫双威(thiodicarb)、久效威(thiofanox)、啞蚜威(triazamate)、混杀威(trimethacarb)、灭除威(XMC)和灭杀威(xylylcarb);或有机磷酸酯类,乙酰甲胺磷(acephate)、例如甲基吡啶磷(azamethiphos)、乙基谷硫磷(azinphos-ethyl)、甲基谷硫磷(azinphos-methyl)、硫线磷(cadusafos)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、毒虫畏(chlorfenvinphos)、氯甲硫磷(chlormephos)、毒死蜱(chloropyrifos)、甲基毒死蜱(chloropyrifos-methyl)、蝇毒磷(coumaphos)、杀螟腈(cyanophos)、甲基内吸磷(demeton-S-methyl)、二嗪农(diazinon)、敌敌畏(dichlorvos/DDVP)、百治磷(dicrotophos)、乐果(dimethoate)、甲基毒虫畏(dimethylvinphos)、乙拌磷(disulphoton)、苯硫磷(EPN)、乙硫磷(ethion)、灭线磷(ethoprophos)、伐灭磷(famphur)、苯线磷(fenamiphos)、杀螟松(fenitrothion)、倍硫磷(fenthion)、噁唑磷(fosthiazate)、庚烯磷(heptenophos)、imicyafos、异柳磷(isofenphos)、邻-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸异丙酯、异噁唑啉(isoxathion)、马拉硫磷(malathion)、灭蚜磷(mecarbam)、甲胺磷(methamidophos)、杀扑磷(methidathion)、速灭磷(mevinphos)、久效磷(monocrotophos)、二溴磷(naled)、氧乐果(omethoate)、亚砷磷(oxydemeton-methyl)、对硫磷(parathion)、

对硫磷甲酯(parathion-methyl)、稻丰散(phenthoate)、甲拌磷(phorate)、伏杀磷(phosalone)、亚胺硫磷(phosmet)、磷胺(phosphamidon)、膈硫磷(phoxim)、甲基吡啶磷(pirimiphos-methyl)、丙溴磷(profenofos)、胺丙畏(propetamphos)、丙硫磷(prothiofos)、吡唑硫磷(pyraclufos)、哒嗪硫磷(pyridaphenthion)、喹硫磷(quinalphos)、治螟磷(sulphotep)、丁基吡啶磷(tebupirimfos)、双硫磷(temephos)、特丁硫磷(terbufos)、杀虫畏(tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷(thiometon)、三唑磷(triazophos)、敌百虫(triclorfon)和蚜灭磷(vamidothion)。

[1013] (2) GABA-门控氯离子通道拮抗剂,例如环戊二烯有机氯类,例如氯丹(chlordane)和硫丹(endosulphan);或苯基吡唑类(fiproles),例如乙虫腈(ethiprole)和氟虫腈(fipronil)。

[1014] (3) 钠通道调节剂/电压门控钠通道阻滞剂,例如拟除虫菊酯(pyrethroid)类,例如氟丙菊酯(acrinathrin)、丙烯除虫菊酯(allethrin)、d-顺-反丙烯除虫菊酯(d-cis-trans allethrin)、d-反丙烯除虫菊酯(d-trans allethrin)、联苯菊酯(bifenthrin)、生物烯丙菊酯(bioallethrin)、生物烯丙菊酯S-环戊烯基异构体(bioallethrin S-cyclopentenyl isomer)、生物苄呋菊酯(bioresmethrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、氟氰菊酯(cyfluthrin)、 β -氟氰菊酯(beta-cyfluthrin)、氯氟氰菊酯(cyhalothrin)、 λ -氯氟氰菊酯(lambda-cyhalothrin)、 γ -氯氟氰菊酯(gamma-cyhalothrin)、氯氰菊酯(cypermethrin)、 α -氯氰菊酯(alpha-cypermethrin)、 β -氯氰菊酯(beta-cypermethrin)、 θ -氯氰菊酯(theta-cypermethrin)、 ζ -氯氰菊酯(zeta-cypermethrin)、苯醚氰菊酯[(1R)-反式异构体](cyphenothrin[(1R)-trans isomers])、溴氰菊酯(deltamethrin)、右旋烯炔菊酯[(E)- (1R) 异构体](empenthrin[(E)- (1R) isomers])、高氰戊菊酯(esfenvalerate)、醚菊酯(etofenprox)、甲氰菊酯(fenpropathrin)、氰戊菊酯(fenvalerate)、氟氰戊菊酯(flucythrinate)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、 τ -氟胺氰菊酯(tau-fluvalinate)、苄呋醚(halfenprox)、炔咪菊酯(imiprothrin)、噻恩菊酯(kadethrin)、甲氧苄氟菊酯(momfluorothrin)、苄氯菊酯(permethrin)、苯醚菊酯[(1R)-反式异构体](phenothrin[(1R)-trans isomer])、炔丙菊酯(prallethrin)、除虫菊酯(pyrethrine、pyrethrum)、苄呋菊酯(resmethrin)、氟硅菊酯(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin)、胺菊酯(tetramethrin)、胺菊酯[(1R)异构体](tetramethrin[(1R) isomers]))、四溴菊酯(tralomethrin)和四氟苯菊酯(transfluthrin);或DDT;或甲氧氯。

[1015] (4) 烟碱型乙酰胆碱受体(nAChR)激动剂,例如新烟碱类(neonicotinoids),例如啉虫脒(acetamiprid)、噻虫胺(clothianidin)、呋虫胺(dinotefuran)、吡虫啉(imidacloprid)、烯啉虫胺(nitenpyram)、噻虫啉(thiacloprid)和噻虫嗪(thiamethoxam)或尼古丁(nicotine)或氟啉虫胺脒(sulphoxaflor)或氟吡呋喃酮(flupyradifurone)。

[1016] (5) 烟碱乙酰胆碱受体(nAChR)的变构激活剂,例如多杀菌素类(spinosyns),如乙基多杀菌素(spinetoram)和多杀菌素(spinosad)。

[1017] (6) 氯离子通道活化剂,例如,阿维菌素类/米尔倍霉素类(avermectins/milbemycins),例如阿维菌素(abamectin)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐(emamectin benzoate)、雷皮菌素(lepimectin)和灭螨菌素(milbemectin)。

[1018] (7) 保幼激素模仿物,例如,保幼激素类似物如烯虫乙酯(hydroprene)、烯虫炔酯

(kinoprene) 和烯虫酯 (methoprene) 或苯氧威 (fenoxycarb) 或蚊蝇醚 (pyriproxyfen)。

[1019] (8) 具有未知的或非特异性作用机制的活性化合物, 例如

[1020] 烷基卤化物, 例如甲基溴化物和其他烷基卤化物; 或氯化苦 (chloropicrine) 或硫酰氟或硼砂或吐酒石 (tartar emetic)。

[1021] (9) 选择性拒食剂, 例如吡蚜酮 (pymetrozine) 或氟啶虫酰胺 (flonicamid)。

[1022] (10) 螨生长抑制剂, 例如四螨嗪、噻螨酮和氟螨嗪 (diflovidazin) 或乙螨唑 (etoxazole)。

[1023] (11) 昆虫肠膜的微生物干扰剂, 例如苏云金芽孢杆菌以色列亚种 (*Bacillus thuringiensis* subspecies *israelensis*)、球形芽孢杆菌 (*Bacillus sphaericus*)、苏云金芽孢杆菌鮎泽亚种 (*Bacillus thuringiensis* subspecies *aizawai*)、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种 (*Bacillus thuringiensis* subspecies *kurstaki*)、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种 (*Bacillus thuringiensis* subspecies *tenebrionis*) 和BT植物蛋白: Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab1。

[1024] (12) 氧化磷酸化抑制剂、ATP干扰剂, 例如丁醚脲或有机锡化合物, 例如三唑锡、三环锡和苯丁锡 (fenbutatin oxide) 或克螨特 (propargite) 或四氯杀螨砜 (tetradifon)。

[1025] (13) 中断H⁺质子梯度的氧化磷酸化去耦剂, 例如虫螨腈 (chlorfenapyr)、二硝甲酚 (DNOC) 和氟虫胺 (sulphluramid)。

[1026] (14) 烟碱型乙酰胆碱受体拮抗剂, 例如杀虫磺 (bensultap)、杀螟丹盐酸盐 (cartap hydrochloride)、杀虫环 (thiocyclam) 和杀虫双 (thiosultap-sodium)。

[1027] (15) 几丁质生物合成抑制剂, 0型, 例如双三氟虫脲 (bistrifluron)、定虫隆 (chlofluazuron)、除虫脲 (diflubenzuron)、氟环脲 (flucyclozuron)、氟虫脲 (flufenoxuron)、氟铃脲 (hexaflumuron)、虱螨脲 (lufenuron)、双苯氟脲 (novaluron)、多氟脲 (noviflumuron)、氟苯脲 (teflubenzuron) 和杀铃脲 (triflumuron)。

[1028] (16) 几丁质生物合成抑制剂, 1型, 例如噻嗪酮 (buprofezin)。

[1029] (17) 蜕皮抑制剂 (特别是对于双翅目 (Diptera), 即双翅目 (dipterans)), 例如灭蝇胺 (cyromazine)。

[1030] (18) 蜕皮激素受体激动剂, 例如环虫酰胺 (chromafenozide)、氯虫酰肼 (halofenozide)、甲氧虫酰肼 (methoxyfenozide) 和虫酰肼 (tebufenozide)。

[1031] (19) 章鱼胺能激动剂, 例如双甲脒 (amitraz)。

[1032] (20) 复合物-III型电子传递抑制剂, 例如氟蚁腓 (hydramethylnone), 或灭螨醌 (acequinocyl), 或噻螨酯 (fluacrypyrim)。

[1033] (21) 复合物-I型电子传递抑制剂, 例如METI杀螨剂, 例如啞螨醚 (fenazaquin)、啞螨酯 (fenpyroximate)、啞螨醚 (pyrimidifen)、啞螨灵 (pyridaben)、吡螨胺 (tebufenpyrad) 和啞虫酰胺 (tolfenpyrad); 或鱼藤酮 (rotenone) (鱼藤)。

[1034] (22) 电压门控钠通道阻断剂, 例如茚虫威 (indoxacarb) 或氟氟虫脒 (metaflumizone)。

[1035] (23) 乙酰基-CoA羧化酶的抑制剂, 例如季酮酸 (tetronic) 和特特拉姆酸 (tetramic acid) 衍生物, 例如螺螨酯 (spirodiclofen)、螺甲螨酯 (spiromesifen) 和螺虫乙酯 (spirotetramat)。

[1036] (24) 复合物-IV型电子传递抑制剂,例如膦类,如磷化铝、磷化钙、膦和磷化锌;或氰化物。

[1037] (25) 复合物-II型电子传递抑制剂,例如腈吡螨酯(cyenopyrafen)和丁氟螨酯(cyflumetofen)。

[1038] (28) 鱼尼丁受体效应剂,例如二酰胺类,如氯虫苯甲酰胺(chlorantraniliprole)、溴氰虫酰胺(cyantraniliprole)和氟虫双酰胺(flubendiamide);

[1039] 其它具有未知或不清楚的作用机制的活性化合物,例如afidopyropen、阿福拉纳(afoxolaner)、印楝素(azadirachtin)、benclouthiaz、苯螨特(benzoximate)、联苯肼酯(bifenazate)、broflanilide、溴螨酯(bromopropylate)、灭螨锰(chinomethionat)、冰晶石(cryolite)、cyclaniliprole、环氧虫啉(cycloxaprid)、氯氟氰虫酰胺(cyhalodiamide)、dicloromezotiaz、三氯杀螨醇(dicofol)、氟螨啉(diflovidazin)、flometoquin、fluazaindolizine、氟噻虫砒(flusulphone)、嘧虫胺(flufenerim)、氟菌螨酯(flufenoxystrobin)、丁虫腈(flufiprole)、fluhexafon、氟吡菌酰胺(fluopyram)、fluralaner、fluxametamide、呋喃虫酰肼(fufenozide)、guadipyr、heptafluthrin、氯噻啉(imidaclothiz)、异菌脲(iprodione)、lotilaner、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、哌虫啉(paichongding)、pyflubumide、三氟甲吡啶(pyridalyl)、pyrifluquinazon、嘧螨胺(pyriminostrobin)、sarolaner、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)、tetrilaniliprole、氟氰虫酰胺(tetrachlorantraniliprole)、tioazafen、硫氟脒(thiofluoaximate)、triflumezopyrim和碘甲烷(iodomethane);并且除此之外基于坚强芽孢杆菌(*Bacillus firmus*, I-1582, BioNeem, Votivo)的制品,以及下列已知的活性化合物:1-{2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亚磺酰基]苯基}-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺(由W02006/043635已知)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吡啶-3,4'-哌啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲酮(由W02003/106457已知)、2-氯-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]哌啶-4-基}-4-(三氟甲基)苯基]异烟酰胺(由W02006/003494已知)、3-(2,5-二甲基苯基)-4-羟基-8-甲氧基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(由W02009/049851已知)、3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙基碳酸(由W02009/049851已知)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基哌啶-1-基)-5-氟嘧啶(由W02004/099160已知)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3-氯苯基)嘧啶(由W02003/076415已知)、PF1364(CAS登记号1204776-60-2)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)-5-氯-3-甲基苯甲酰基]-2-甲基肼甲酸甲酯(由W02005/085216已知)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)-5-氰基-3-甲基苯甲酰基]-2-乙基肼甲酸甲酯(由W02005/085216已知)、2-[2-({[3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]羰基}氨基)-5-氰基-3-甲基苯甲酰基]-2-乙基肼甲酸甲酯(由W02005/085216已知)、N-[2-(5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-甲酰胺(由CN102057925已知)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-2-甲基-N-(1-氧化硫杂环丁烷-3-基)苯甲酰胺(由W02009/080250已知)、N-[(2E)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]吡啶-2(1H)-亚

基]-2,2,2-三氟乙酰胺(由W02012/029672已知)、1-[(2-氯-1,3-噻唑-5-基)甲基]-4-氧代-3-苯基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶-1-鎓-2-酚盐(由W02009/099929已知)、1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]-4-氧代-3-苯基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶-1-鎓-2-酚盐(由W02009/099929已知)、4-(3-{2,6-二氯-4-[(3,3-二氯丙-2-烯-1-基)氧基]苯氧基}丙氧基)-2-甲氧基-6-(三氟甲基)嘧啶(由CN101337940已知)、N-[2-(叔丁基氨基甲酰基)-4-氯-6-甲基苯基]-1-(3-氯吡啶-2-基)-3-(氟甲氧基)-1H-吡唑-5-甲酰胺(由W02008/134969已知)、[2-(2,4-二氯苯基)-3-氧代-4-氧杂螺[4.5]癸-1-烯-1-基]碳酸丁酯(由CN 102060818已知)、3E)-3-[1-[(6-氯-3-吡啶)甲基]-2-吡啶亚基]-1,1,1-三氟丙烷-2-酮(由W02013/144213已知)、N-(甲基磺酰基)-6-[2-(吡啶-3-基)-1,3-噻唑-5-基]吡啶-2-甲酰胺(由W02012/000896已知)、N-[3-(苄基氨基甲酰基)-4-氯苯基]-1-甲基-3-(五氟乙基)-4-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-甲酰胺(由W02010/051926已知)、5-溴-4-氯-N-[4-氯-2-甲基-6-(甲基氨基甲酰基)苯基]-2-(3-氯-2-吡啶)吡唑-3-甲酰胺(由CN103232431已知)。

[1040] 杀真菌剂

[1041] 本文通过其通用名指定的活性化合物是已知的并且例如描述于“农药手册”中或因特网(例如:<http://www.alanwood.net/pesticides>)上。

[1042] 如果存在合适的官能团,列于类别(1)至(15)中的所有杀真菌混合组分可以任选与相应的碱或酸形成盐。此外,在互变异构可能的情况下,类别(1)至(15)中列出的杀真菌混合组分还包括互变异构形式。

[1043] 1) 麦角甾醇生物合成抑制剂,例如(1.01)艾敌吗啉(aldimorph)、(1.02)戊环唑(azaconazole)、(1.03)联苯三唑醇(bitertanol)、(1.04)糠菌唑(bromuconazole)、(1.05)环丙唑醇(cyproconazole)、(1.06)苄氯三唑醇(diclobutrazole)、(1.07)噁醚唑(difenoconazole)、(1.08)烯唑醇(diniconazole)、(1.09)高效烯唑醇(diniconazole-M)、(1.10)吗菌灵(dodemorph)、(1.11)吗菌灵乙酸盐(dodemorph acetate)、(1.12)氟环唑(epoxiconazole)、(1.13)乙环唑(etaconazole)、(1.14)氯苯吡啶醇(fenarimol)、(1.15)腈苯唑(fenbuconazole)、(1.16)环酰菌胺(fenhexamide)、(1.17)苯锈啶(fenpropidin)、(1.18)丁苯吗啉(fenpropimorph)、(1.19)氟喹唑(flquinconazole)、(1.20)调啉醇(flurprimidol)、(1.21)氟硅唑(flusilazole)、(1.22)粉唑醇(flutriazole)、(1.23)呋菌唑(furconazole)、(1.24)顺呋醚唑(furconazole-cis)、(1.25)己唑醇(hexaconazole)、(1.26)烯菌灵(imazalil)、(1.27)烯菌灵硫酸盐(imazalil sulfate)、(1.28)酰胺唑(imibenconazole)、(1.29)种菌唑(ipconazole)、(1.30)叶菌唑(metconazole)、(1.31)腈菌唑(myclobutanil)、(1.32)萘替芬(naftifine)、(1.33)氟苯吡啶醇(nuarimol)、(1.34)噁咪唑(oxpoconazole)、(1.35)多效唑(paclobutrazol)、(1.36)稻瘟酯(pefurazoate)、(1.37)戊菌唑(penconazole)、(1.38)粉病灵(piperalin)、(1.39)咪鲜胺(prochloraz)、(1.40)丙环唑(propiconazole)、(1.41)丙硫菌唑(prothioconazole)、(1.42)稗草畏(pyributicarb)、(1.43)啉斑肟(pyrifenoxy)、(1.44)唑啉菌酮(quinconazole)、(1.45)硅氟唑(simeconazole)、(1.46)螺环菌胺(spiroxamine)、(1.47)戊唑醇(tebuconazole)、(1.48)特比萘芬(terbinafin)、(1.49)氟醚唑(tetraconazole)、(1.50)三唑酮(triadimefon)、(1.51)三唑醇(triadimenol)、(1.52)克啉菌(tridemorph)、(1.53)氟菌唑(triflumizole)、(1.54)啉氨灵(triforin)、(1.55)灭菌唑(triticonazole)、(1.56)烯效

唑(uniconazole)、(1.57)精烯效唑(uniconazole-p)、(1.58)烯霜苄唑(viniconazole)、(1.59)伏立康唑(voriconazole)、(1.60)1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)环庚醇、(1.61)1-(2,2-二甲基-2,3-二氢-1H-茛-1-基)-1H-咪唑-5-甲酸甲酯、(1.62)N'-{5-(二氟甲基)-2-甲基-4-[3-(三甲基甲硅烷基)丙氧基]苯基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(1.63)N-乙基-N-甲基-N'-{2-甲基-5-(三氟甲基)-4-[3-(三甲基甲硅烷基)丙氧基]苯基}甲脒、(1.64)邻-[1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁烷-2-基]1H-咪唑-1-硫代甲酸酯、(1.65)啉菌唑(pyrisoxazole)、(1.66)2-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.67)1-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.68)5-(烯丙基硫烷基)-1-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(1.69)2-[1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.70)2-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.71)2-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.72)1-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.73)1-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基硫氰酸酯、(1.74)5-(烯丙基硫烷基)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(1.75)5-(烯丙基硫烷基)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)环氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(1.76)2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.77)2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.78)2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.79)2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.80)2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.81)2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.82)2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.83)2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羟基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.84)2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.85)2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.86)2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)戊-2-醇、(1.87)2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.88)2-[2-氯-4-(2,4-二氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.89)(2R)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.90)(2R)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.91)(2S)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.92)(2S)-2-(1-氯环丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯环丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.93)(1S,2R,5R)-5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)甲基)环戊醇、(1.94)(1R,2S,5S)-5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-

甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇、(1.95)5-(4-氯苄基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)环戊醇。

[1044] 2) 作用于复合物I或II的呼吸链抑制剂,例如(2.01)联苯吡菌胺(bixafen)、(2.02)啶酰菌胺(boscalid)、(2.03)萎锈灵(carboxin)、(2.04)氟嘧菌胺(diflumetorim)、(2.05)甲呋酰胺(fenfuram)、(2.06)氟吡菌酰胺(fluopyram)、(2.07)氟酰胺(flutolanil)、(2.08)氟唑菌酰胺(fluxapyroxad)、(2.09)呋吡菌胺(furametpyr)、(2.10)拌种胺(furmecyclox)、(2.11)吡唑萘菌胺(isopyrazam)(顺式差向异构外消旋体1RS、4SR、9RS和反式差向异构外消旋体1RS、4SR、9SR的混合物)、(2.12)吡唑萘菌胺(反式差向异构外消旋体1RS、4SR、9SR)、(2.13)吡唑萘菌胺(反式差向异构对映异构体1R、4S、9S)、(2.14)吡唑萘菌胺(反式差向异构对映异构体1S、4R、9R)、(2.15)吡唑萘菌胺(顺式差向异构外消旋体1RS、4SR、9RS)、(2.16)吡唑萘菌胺(顺式差向异构对映异构体1R、4S、9R)、(2.17)吡唑萘菌胺(顺式差向异构对映异构体1S、4R、9S)、(2.18)灭锈胺(meppronil)、(2.19)氧化萎锈灵(oxycarboxin)、(2.20)氟唑菌苯胺(penflufen)、(2.21)吡噻菌胺(penthiopyrad)、(2.22)氟唑环菌胺(sedaxane)、(2.23)噻氟菌胺(thi fluzamide)、(2.24)1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.25)3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.26)3-(二氟甲基)-N-[4-氟-2-(1,1,2,3,3,3-六氟丙氧基)苯基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.27)N-[1-(2,4-二氯苯基)-1-甲氧基丙-2-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.28)5,8-二氟-N-[2-(2-氟-4-{[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]氧基}苯基)乙基]喹唑啉-4-胺、(2.29)苯并烯氟菌唑(benzovindiflupyr)、(2.30)N-[(1S,4R)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-甲醇萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.31)N-[(1R,4S)-9-(二氯亚甲基)-1,2,3,4-四氢-1,4-甲醇萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.32)3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.33)1,3,5-三甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.34)1-甲基-3-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.35)1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.36)1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.37)3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.38)3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.39)1,3,5-三甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.40)1,3,5-三甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.41)麦锈灵(benodanil)、(2.42)2-氯-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)吡啶-3-甲酰胺、(2.43)噻吩酰菌酮(isofetamid)、(2.44)1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[2'-(三氟甲基)联苯基-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.45)N-(4'-氯联苯基-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.46)N-(2',4'-二氯联苯基-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.47)3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(三氟甲基)联苯基-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.48)N-(2',5'-二氟联苯基-2-基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.49)3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[4'-(丙-1-炔-1-基)联苯基-2-基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(2.50)5-氟-1,3-二甲

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

[1045] 3) 作用于复合物III的呼吸链抑制剂,例如(3.01) 唑啉菌胺(ametoctradin)、(3.02) 安美速(amisulbrom)、(3.03) 啞菌酯(azoxystrobin)、(3.04) 氰霜唑(cyazofamid)、(3.05) 甲香菌酯(coumethoxystrobin)、(3.06) 丁香菌酯(coumoxystrobin)、(3.07) 醚菌胺(dimoxystrobin)、(3.08) 烯肟菌酯(enoxastrobin)、(3.09) 噁唑菌酮(famoxadon)、(3.10) 咪唑菌酮(fenamidon)、(3.11) 氟菌螨酯(flufenoxystrobin)、(3.12) 氟啞菌酯(fluxastrobin)、(3.13) 醚菌酯(kresoxim-methyl) (3.14) 苯氧菌胺(metominostrobin)、(3.15) 肟醚菌胺(orysastrobin)、(3.16) 啞氧菌酯(picoxystrobin)、(3.17) 唑菌胺酯(pyraclostrobin)、(3.18) 唑胺菌酯(pyrametostrobin)、(3.19) 唑啞菌酯(pyraoxystrobin)、(3.20) 吡菌苯威(pyribencarb)、(3.21) 氯啞菌酯(triclopyricarb)、(3.22) 肟菌酯(trifloxystrobin)、(3.23) (2E)-2-(2-{{[6-(3-氯-2-甲基苯氧基)-5-氟啞啞-4-基]氧基}苯基}-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、(3.24) (2E)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-2-(2-{{((1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基}氨基)氧基}甲基}苯基)乙酰胺、(3.25) (2E)-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基-2-{2-[(E)-({1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基}亚氨基)甲基}苯基]乙酰胺、(3.26) (2E)-2-{2-[(E)-1-(3-{{(E)-1-氟-2-苯基乙烯基}氧基}苯基)亚乙基}氨基]氧基}甲基}苯基}-2-(甲氧基亚氨基)-N-甲基乙酰胺、(3.27) fenaminostrobin、(3.28) 5-甲氧基-2-甲基-4-(2-{{((1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基}氨基)氧基}甲基}苯基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮、(3.29) (2E)-2-{2-[(环丙基[(4-甲氧基苯基)亚氨基]甲基]硫烷基)甲基}苯基}-3-甲氧基丙烯酸甲酯、(3.30) N-(3-乙

基-3,5,5-三甲基环己基)-3-甲酰胺基-2-羟基苯甲酰胺、(3.31) 2-[2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基]-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺、(3.32) 2-[2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基]-2-甲氧基-N-甲基乙酰胺、(3.33) (2E,3Z)-5-[[1-(4-氯苯基)-1H-吡唑-3-基]氧基]-2-(甲氧基亚氨基)-N,3-二甲基戊-3-烯酰胺。

[1046] 4) 有丝分裂和细胞分裂抑制剂,例如(4.01) 苯菌灵(benomyl)、(4.02) 多菌灵(carbendazim)、(4.03) chlorfenazole、(4.04) 乙霉威(diethofencarb)、(4.05) 噻唑菌胺(ethaboxam)、(4.06) 氟吡菌胺(fluopicolide)、(4.07) 麦穗宁(fuberidazole)、(4.08) 戊菌隆(pencycuron)、(4.09) 噻苯咪唑(thiabendazole)、(4.10) 甲基硫菌灵(thiophanate-methyl)、(4.11) 硫菌灵(thiophanate)、(4.12) 苯酰菌胺(zoxamide)、(4.13) 5-氯-7-(4-甲基哌啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶、(4.14) 3-氯-5-(6-氯吡啶-3-基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)哒嗪。

[1047] 5) 能够具有多位点作用的化合物,例如,(5.01) 波尔多液(bordeaux mixture)、(5.02) 敌菌丹(captafol)、(5.03) 克菌丹(captan)、(5.04) 百菌清(chlorothalonil)、(5.05) 氢氧化铜、(5.06) 环烷酸铜(copper naphthenate)、(5.07) 氧化铜、(5.08) 氧氯化铜(copper oxychloride)、(5.09) 硫酸铜(2+)(copper(2+) sulfate)、(5.10) 抑菌灵(dichlofluanid)、(5.11) 二噻农(dithianon)、(5.12) 多果定(dodine)、(5.13) 多果定游离碱(dodinefree base)、(5.14) 福美铁(ferbam)、(5.15) 氟灭菌丹(fluorofolpet)、(5.16) 灭菌丹(folpet)、(5.17) 双胍辛盐(guazatine)、(5.18) 双胍辛乙酸盐(guazatine acetate)、(5.19) 双胍辛胺(iminoctadine)、(5.20) 双胍辛胺苯磺酸盐(iminoctadine albesilate)、(5.21) 双胍辛胺三乙酸盐(iminoctadine triacetate)、(5.22) 代森锰铜(mancopper)、(5.23) 代森锰锌(mancozeb)、(5.24) 代森锰(maneb)、(5.25) 代森联(metiram)、(5.26) 代森联锌(metiram zinc)、(5.27) 喹啉铜(oxine-copper)、(5.28) 丙烷脒(propamidine)、(5.29) 丙森锌(propineb)、(5.30) 硫和硫制剂包括多硫化钙、(5.31) 福美双(thiram)、(5.32) 对甲抑菌灵(tolylfluanid)、(5.33) 代森锌(zineb)、(5.34) 福美锌(ziram)、(5.35) 敌菌灵(anilazine)。

[1048] 6) 能够诱导宿主防御的化合物,例如(6.01) 苯并噻二唑(acibenzolar-S-methyl)、(6.02) 异噻菌胺(isotianil)、(6.03) 噻菌灵(probenazole)、(6.04) 噻酰菌胺(tiadinil)、(6.05) 昆布多糖(laminarin)。

[1049] 7) 氨基酸和/或蛋白质生物合成抑制剂,例如(7.01) andoprim、(7.02) 灭瘟素(blasticidin-S)、(7.03) 嘧菌环胺(cyprodinil)、(7.04) 春雷霉素(kasugamycin)、(7.05) 春雷霉素盐酸盐水合物(kasugamycin hydrochloride hydrate)、(7.06) 嘧菌胺(mepanipyrim)、(7.07) 嘧霉胺(pyrimethanil)、(7.08) 3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉、(7.09) 土霉素(oxytetracycline)、(7.10) 链霉素(streptomycin)。

[1050] 8) ATP生成抑制剂,例如(8.01) 薯瘟锡(fentin acetate)、(8.02) 三苯锡氯(fentin chloride)、(8.03) 毒菌锡(fentin hydroxide)、(8.04) 硅噻菌胺(silthiofam)。

[1051] 9) 细胞壁合成抑制剂,例如(9.01) 苯噻菌胺(benthiavalicarb)、(9.02) 烯酰吗啉(dimethomorph)、(9.03) 氟吗啉(flumorph)、(9.04) 缙霉威(iprovalicarb)、(9.05) 双炔酰菌胺(mandipropamid)、(9.06) 多抗霉素(polyoxins)、(9.07) 保粒霉素(polyoxorim)、(9.08) 井冈霉素A(validamycin A)、(9.09) 缙菌胺(valifenalate)、(9.10) 多氧菌素B

(polyoxin B)、(9.11) (2E)-3-(4-叔丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(吗啉-4-基)丙-2-烯-1-酮、(9.12) (2Z)-3-(4-叔丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(吗啉-4-基)丙-2-烯-1-酮。

[1052] 10) 脂类和膜合成抑制剂,例如(10.01)联苯、(10.02)地茂散(chloroneb)、(10.03)氯硝胺(dicloran)、(10.04)克瘟散(edifenphos)、(10.05)土菌灵(etridiazole)、(10.06)依杜卡(iodocarb)、(10.07)异稻瘟净(iprobenfos)、(10.08)稻瘟灵(isoprothiolane)、(10.09)霜霉威(propamocarb)、(10.10)霜霉威盐酸盐(propamocarb hydrochloride)、(10.11)硫菌威(prothiocarb)、(10.12)吡菌磷(pyrazophos)、(10.13)五氯硝基苯(quintozene)、(10.14)四氧硝基苯(tecnazene)、(10.15)甲基立枯磷(tolclofos-methyl)。

[1053] 11) 黑色素生物合成抑制剂,例如(11.01)加普胺(carpropamid)、(11.02)双氯氰菌胺(diclocymet)、(11.03)稻瘟酰胺(fenoxanil)、(11.04)四氯苯酞(phthalide)、(11.05)咯嗉酮(pyroquilon)、(11.06)三环唑(tricyclazole)、(11.07)2,2,2-三氟乙基{3-甲基-1-[(4-甲基苯甲酰基)氨基]丁烷-2-基}氨基甲酸酯。

[1054] 12) 核酸合成抑制剂,例如,(12.01)苯霜灵(benalaxyl)、(12.02)高效苯霜灵(benalaxyl-M)(kiralaxyl)、(12.03)磺酸丁吡啶(bupirimate)、(12.04)clozylacon、(12.05)甲菌定(dimethirimol)、(12.06)乙菌定(ethirimol)、(12.07)呋霜灵(furalaxyl)、(12.08)噁霉灵(hymexazol)、(12.09)甲霜灵(metalaxyl)、(12.10)高效甲霜灵(metalaxyl-M)(mefenoxam)、(12.11)甲呋酰胺(ofurace)、(12.12)噁霜灵(oxadixyl)、(12.13)噁嗉酸(oxolinic acid)、(12.14)辛噁酮(octhilinone)。

[1055] 13) 信号转导抑制剂,例如(13.01)乙菌利(chlozolinat)、(13.02)拌种咯(fenpiclonil)、(13.03)咯菌腈(fludioxonil)、(13.04)异菌脲(iprodione)、(13.05)腐霉利(procymidone)、(13.06)喹氧灵(quinoxyfen)、(13.07)乙烯菌核利(vinclozolin)、(13.08)丙氧喹啉(proquinazid)。

[1056] 14) 能够作为解偶联剂的化合物,例如(14.01)乐杀螨(binapacryl)、(14.02)敌螨普(dinocap)、(14.03)噁菌腈(ferimzone)、(14.04)氟啶胺(fluzinam)、(14.05)消螨多(meptyldinocap)。

[1057] 15) 其他化合物,例如(15.001)苯噁硫氰(benthiazole)、(15.002)bethoxazin、(15.003)卡巴西霉素(capsimycin)、(15.004)香芹酮(carvone)、(15.005)喹甲硫酯(quinomethionate)、(15.006)pyriofenone(chlazafenone)、(15.007)硫杂灵(cufraneb)、(15.008)环氟菌胺(cyflufenamid)、(15.009)霜脲氰(cymoxanil)、(15.010)环丙磺酰胺(cyprosulphamide)、(15.011)棉隆(dazomet)、(15.012)咪菌威(debacarb)、(15.013)双氯酚(dichlorophen)、(15.014)哒菌酮(diclomezin)、(15.015)野燕枯(difenzoquat)、(15.016)野燕枯甲基硫酸盐(difenzoquat metilsulphate)、(15.017)二苯胺(diphenylamine)、(15.018)Ecomate、(15.019)胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)、(15.020)氟联苯菌(flumetover)、(15.021)氟菌丹(fluoroimide)、(15.022)磺菌胺(flusulphamide)、(15.023)flutianil、(15.024)三乙膦酸铝(fosetyl-aluminium)、(15.025)乙膦酸钙(fosetyl-calcium)、(15.026)乙膦酸钠(fosetyl-sodium)、(15.027)六氯苯(hexachlorobenzene)、(15.028)irumamycin、(15.029)磺菌威(methasulphocarb)、

(15.030) 异硫氰酸甲酯 (methyl isothiocyanate)、(15.031) 苯菌酮 (metrafenone)、(15.032) 灭粉霉素 (mildiomycin)、(15.033) 游霉素 (natamycin)、(15.034) 二甲基二硫代氨基甲酸镍 (nickel dimethyldithiocarbamate)、(15.035) 酞菌酯 (nitrothal-isopropyl)、(15.036) oxamocarb、(15.037) oxyfenthiin、(15.038) 五氯苯酚 (pentachlorophenol) 及盐、(15.039) 苯醚菊酯 (phenothrin)、(15.040) 磷酸及盐、(15.041) 霜霉威-乙膦酸盐 (propamocarb-fosetylalte)、(15.042) 丙醇菌素钠 (propanosin-sodium)、(15.043) 丁吡吗啉 (pyrimorph)、(15.044) 吡咯尼林 (pyrrolnitrin)、(15.045) tebufloquin、(15.046) 叶枯酞 (tecloftalam)、(15.047) 甲磺菌胺 (tolnifanid)、(15.048) 咪唑啉 (triazoxide)、(15.049) 水杨菌胺 (trichlamid)、(15.050) 氰菌胺 (zarilamid)、(15.051) (3S,6S,7R,8R)-8-苄基-3-[(3-[(异丁酰氧基)甲氧基]-4-甲氧基吡啶-2-基)羰基]氨基]-6-甲基-4,9-二氧代-1,5-二氧杂环壬烷-7-基-2-甲基丙酸酯、(15.052) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噁唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(15.053) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噁唑-2-基}哌啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮、(15.054) oxathiapiproline、(15.055) 1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁-2-基-1H-咪唑-1-羧酸酯、(15.056) 2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺酰基)吡啶、(15.057) 2,3-二丁基-6-氯噻吩并[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮、(15.058) 2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二噻英并[2,3-c:5,6-c']二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮、(15.059) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[(5R)-5-苄基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噁唑-2-基}哌啶-1-基)乙酮、(15.060) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[(5S)-5-苄基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噁唑-2-基}哌啶-1-基)乙酮、(15.061) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-{4-[4-(5-苄基-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基)-1,3-噁唑-2-基]哌啶-1-基}乙酮、(15.062) 2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4H-苯并吡喃-4-酮、(15.063) 2-氯-5-[2-氯-1-(2,6-二氟-4-甲氧基苯基)-4-甲基-1H-咪唑-5-基]吡啶、(15.064) 2-苄基苯酚和盐、(15.065) 3-(4,4,5-三氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉、(15.066) 3,4,5-三氯吡啶-2,6-二羧酸腈、(15.067) 3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基哒嗪、(15.068) 4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基哒嗪、(15.069) 5-氨基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇、(15.070) 5-氯-N'-苄基-N'-(丙-2-炔-1-基)噻吩-2-磺酰肼、(15.071) 5-氟-2-[(4-氟苄基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.072) 5-氟-2-[(4-甲基苄基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.073) 5-甲基-6-辛基[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-7-胺、(15.074) (2Z)-3-氨基-2-氰基-3-苄基丙烯酸乙酯、(15.075) N'-(4-{[3-(4-氯苄基)-1,2,4-噻二唑-5-基]氧基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.076) N-(4-氯苄基)-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]丙酰胺、(15.077) N-[(4-氯苯基)(氰基)甲基]-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]丙酰胺、(15.078) N-[5-溴-3-氯吡啶-2-基]甲基]-2,4-二氯烟酰胺、(15.079) N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯烟酰胺、(15.080) N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2-氟-4-碘代烟酰胺、(15.081) N-{(E)-[(环丙基甲氧基)亚氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苄基乙酰胺、(15.082) N-{(Z)-[(环丙基甲氧基)亚氨基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基}-2-苄基乙酰胺、(15.083) N'-(4-[3-叔丁基-4-氰基-1,2-噻唑-5-基]氧基)-2-氯-5-甲基苯基)-N-乙基-

N-甲基甲脒、(15.084) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-(1,2,3,4-四氢化萘-1-基)-1,3-噁唑-4-甲酰胺、(15.085) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-[(1R)-1,2,3,4-四氢化萘-1-基]-1,3-噁唑-4-甲酰胺、(15.086) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-N-[(1S)-1,2,3,4-四氢化萘-1-基]-1,3-噁唑-4-甲酰胺、(15.087) {6-[[[(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基]氧基]甲基}吡啶-2-基}氨基甲酸戊酯、(15.088) 吩嗪-1-羧酸、(15.089) 喹啉-8-醇、(15.090) 喹啉-8-醇硫酸酯(2:1)、(15.091) {6-[[[(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基]氧基]甲基}吡啶-2-基}氨基甲酸叔丁酯、(15.092) (5-溴-2-甲氧基-4-甲基吡啶-3-基)(2,3,4-三甲氧基-6-甲基苯基)甲酮、(15.093) N-[2-(4-{[3-(4-氯苯基)丙-2-炔-1-基]氧基}-3-甲氧基苯基)乙基]-N2-(甲基磺酰基)缬氨酰胺、(15.094) 4-氧代-4-[(2-苄基乙基)氨基]丁酸、(15.095) {6-[[[(Z)-(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亚甲基]氨基]氧基]甲基}吡啶-2-基}氨基甲酸丁-3-炔-1-基酯、(15.096) 4-氨基-5-氟嘧啶-2-醇(互变异构形式:4-氨基-5-氟嘧啶-2(1H)-酮)、(15.097) 3,4,5-三羟基苯甲酸丙酯、(15.098) [3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(15.099) (S)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(15.100) (R)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(15.101) 2-氟-6-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氢-1H-茛-4-基)苯甲酰胺、(15.102) 2-(6-苄基吡啶-2-基)喹唑啉、(15.103) 2-[6-(3-氟-4-甲氧基苄基)-5-甲基吡啶-2-基]喹唑啉、(15.104) 3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-3,4-二氢异喹啉-1-基)喹啉、(15.105) 脱落酸、(15.106) N'-[5-溴-6-(2,3-二氢-1H-茛-2-基氧基)-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.107) N'-{5-溴-6-[1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.108) N'-{5-溴-6-[(1R)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.109) N'-{5-溴-6-[(1S)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.110) N'-{5-溴-6-[(顺式-4-异丙基环己基)氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.111) N'-{5-溴-6-[(反式-4-异丙基环己基)氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.112) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.113) N-环丙基-N-(2-环丙基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.114) N-(2-叔丁基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.115) N-(5-氯-2-乙基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.116) N-(5-氯-2-异丙基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.117) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(5-氟-2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.118) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(5-氟-2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.119) N-环丙基-N-(2-环丙基-5-氟苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.120) N-(2-环戊基-5-氟苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.121) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-氟-6-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.122) N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.123) N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基-5-甲基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.124) N-环丙基-N-(2-环

丙基-5-甲基苄基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.125)N-(2-叔丁基-5-甲基苄基)-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.126)N-[5-氯-2-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.127)N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-N-[5-甲基-2-(三氟甲基)苄基]-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.128)N-[2-氯-6-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.129)N-[3-氯-2-氟-6-(三氟甲基)苄基]-N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.130)N-环丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-4,5-二甲基苄基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺、(15.131)N-环丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-异丙基苄基)-1-甲基-1H-吡唑-4-硫代酰胺、(15.132)N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基苄基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.133)N'-(4-[(4,5-二氯-1,3-噁唑-2-基)氧基]-2,5-二甲基苄基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.134)N-(4-氯-2,6-二氟苄基)-4-(2-氯-4-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.135)9-氟-2,2-二甲基-5-(喹啉-3-基)-2,3-二氢-1,4-苯并氧杂吡啶、(15.136)2-{2-氟-6-[(8-氟-2-甲基喹啉-3-基)氧基]苄基}丙-2-醇、(15.137)2-{2-[(7,8-二氟-2-甲基喹啉-3-基)氧基]-6-氟苄基}丙-2-醇、(15.138)4-(2-氯-4-氟苄基)-N-(2-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.139)4-(2-氯-4-氟苄基)-N-(2,6-二氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.140)4-(2-氯-4-氟苄基)-N-(2-氯-6-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.141)4-(2-溴-4-氟苄基)-N-(2-氯-6-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.142)N-(2-溴-6-氟苄基)-4-(2-氯-4-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.143)4-(2-溴-4-氟苄基)-N-(2-溴苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.144)4-(2-溴-4-氟苄基)-N-(2-溴-6-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.145)4-(2-溴-4-氟苄基)-N-(2-氯苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.146)N-(2-溴苄基)-4-(2-氯-4-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.147)4-(2-氯-4-氟苄基)-N-(2-氯苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.148)4-(2-溴-4-氟苄基)-N-(2,6-二氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.149)4-(2-溴-4-氟苄基)-N-(2-氟苄基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(15.150)N'-(4-{3-[(二氟甲基)硫烷基]苯氧基}-2,5-二甲基苄基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.151)N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(1,1,2,2-四氟乙基)硫烷基]苯氧基}苄基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.152)N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(2,2,2-三氟乙基)硫烷基]苯氧基}苄基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.153)N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(2,2,3,3-四氟丙基)硫烷基]苯氧基}苄基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.154)N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(五氟乙基)硫烷基]苯氧基}苄基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.155)N'-(4-{[3-(二氟甲氧基)苄基]硫烷基}-2,5-二甲基苄基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.156)N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苄基]硫烷基}苄基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.157)N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(2,2,2-三氟乙氧基)苄基]硫烷基}苄基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.158)N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(2,2,3,3-四氟丙氧基)苄基]硫烷基}苄基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.159)N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(五氟乙氧基)苄基]硫烷基}苄基)-N-乙基-N-甲基甲脒、(15.160)2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苄基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噁唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.161)2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苄基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噁唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.162)2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{5-

[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.163)2-[3-[2-(1-{[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基]苯基甲磺酸酯、(15.164)2-[3-[2-(1-{[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基]-3-氯苯基甲磺酸酯、(15.165)2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.166)2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.167)2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.168)2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.169)2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.170)2-[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]乙酮、(15.171)2-[(5S)-3-[2-(1-{[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基]苯基甲磺酸酯、(15.172)2-[(5R)-3-[2-(1-{[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基]苯基甲磺酸酯、(15.173)2-[(5S)-3-[2-(1-{[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基]-3-氯苯基甲磺酸酯、(15.174)2-[(5R)-3-[2-(1-{[3,5-二(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酰基}哌啶-4-基)-1,3-噻唑-4-基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基]-3-氯苯基甲磺酸酯。

[1058] 作为混合组分的生物农药

[1059] 式(I)的化合物可与生物农药结合。

[1060] 生物农药尤其包括细菌、真菌、酵母、植物提取物和由微生物形成的产品,包括蛋白质和次级代谢物。

[1061] 生物农药包括细菌如产芽孢细菌(spore-forming bacteria)、根定殖细菌(root-colonizing bacteria)和用作生物杀虫剂、杀真菌剂或杀线虫剂的细菌。

[1062] 用作或可用作生物农药的这类细菌的实例为:

[1063] 解淀粉芽孢杆菌(*Bacillus amyloliquefaciens*),菌株FZB42(DSM 231179);或蜡样芽孢杆菌(*Bacillus cereus*),尤其是蜡样芽孢杆菌菌株CNCM I-1562;或者坚强芽孢杆菌(*Bacillus firmus*),菌株I-1582(登录号CNCMI-1582);或短小芽孢杆菌(*Bacillus pumilus*),尤其是菌株GB34(登录号ATCC 700814)和菌株QST2808(登录号NRRL B-30087);或枯草芽孢杆菌(*Bacillus subtilis*),尤其是菌株GB03(登录号ATCC SD-1397),或枯草芽孢杆菌菌株QST713(登录号NRRL B-21661)或枯草芽孢杆菌菌株OST 30002(登录号NRRL B-50421);苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*),尤其是苏云金杆菌以色列亚种(*B.thuringiensis* subspecies *israelensis*)(血清型H-14)、菌株AM65-52(登录号ATCC 1276),或苏云金杆菌鲇泽亚种(*B.thuringiensis* subsp.*aizawai*),尤其是菌株ABTS-1857

(SD-1372),或苏云金杆菌库尔斯塔克亚种(B.

[1064] *thuringiensis* subsp.*kurstaki*) 菌株HD-1,或苏云金杆菌粉虫变种(*thuringiensis* subsp.*tenebrionis*) 菌株NB 176 (SD-5428);侵入巴斯德氏芽菌(*Pasteuria penetrans*)、巴斯德芽菌属(*Pasteuria* spp.) (肾形肾状线虫(*Rotylenchulus reniformis* nematode))-PR3 (登录号ATCC SD-5834);细黄链霉菌(*Streptomyces microflavus*) 菌株AQ6121(=QRD 31.013,NRRL B-50550);鲜黄链霉菌(*Streptomyces galbus*) 菌株AQ 6047(登录号NRRL 30232)。

[1065] 用作或可用作生物农药的真菌和酵母菌的实例为:

[1066] 球孢白僵菌(*Beauveria bassiana*),尤其是菌株ATCC 74040,盾壳霉(*Coniothyrium minitans*),尤其是菌株CON/M/91-8(登录号DSM-9660);轮枝孢属(*Lecanicillium* spp.),尤其是菌株HR0 LEC 12,蜡蚧轮枝菌(*Lecanicillium lecanii*), (以前称为*Verticillium lecanii*),尤其是菌株KV01;金龟子绿僵菌(*Metarhizium anisopliae*),尤其是菌株F52(DSM3884/ATCC 90448);梅奇酵母菌(*Metschnikowia fructicola*),尤其是菌株NRRL Y-30752;玫烟色拟青霉(*Paecilomyces fumosoroseus*) (新名:玫烟色棒束孢(*Isaria fumosorosea*)),尤其是菌株IFPC 200613,或菌株Apopka 97(登录号ATCC 20874);淡紫拟青霉(*Paecilomyces lilacinus*),尤其是淡紫拟青霉菌株251 (AGAL 89/030550);黄色蠕形霉(*Talaromyces flavus*),尤其是菌株V117b;深绿木霉(*Trichoderma atroviride*),尤其是菌株SC1(登录号CBS 122089);哈茨木霉(*Trichoderma harzianum*),尤其是哈茨木霉T39(登录号CNCM I-952)。

[1067] 用作或可用作生物农药的病毒的实例为:

[1068] 棉褐带卷蛾(*Adoxophyes orana*) (夏季水果卷叶蛾(*summer fruit tortrix*)) 颗粒型病毒(GV),苹果蠹蛾(*Cydia pomonella* (*codling moth*)) 颗粒型病毒(GV),棉铃虫(*Helicoverpa armigera* (*cotton bollworm*)) 核型多角体病毒(NPV),甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua* (*beet armyworm*)) mNPV,草地贪夜蛾(*Spodoptera frugiperda* (*秋夜蛾* (*fall armyworm*))) mNPV,海灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis* (*African cotton leafworm*)) NPV。

[1069] 还包括作为“接种剂”添加到植物或植物部位或植物器官中的细菌和真菌,这些细菌和真菌通过其特定性质促进植物生长和植物健康。可以提到的实例为:

[1070] 土壤杆菌属(*Agrobacterium* spp.)、茎瘤固氮根瘤菌(*Azorhizobium caulinodans*)、固氮螺菌属(*Azospirillum* spp.)、固氮菌属(*Azotobacter* spp.)、慢生根瘤菌属(*Bradyrhizobium* spp.)、伯克霍尔德氏菌属(*Burkholderia* spp.) ,尤其是洋葱伯克霍尔德菌(*Burkholderia cepacia*) (以前称为洋葱假单胞菌(*Pseudomonas cepacia*))、巨孢囊霉属(*Gigaspora* spp.)、或*Gigaspora monosporum*、球囊霉属(*Glomus* spp.)、蜡蘑属(*Laccaria* spp.)、布氏乳杆菌(*Lactobacillus buchneri*)、类球囊霉属(*Paraglomus* spp.)、豆包菌(*Pisolithus tinctorus*)、假单胞菌属(*Pseudomonas* spp.)、根瘤菌属(*Rhizobium* spp.) 尤其是三叶草根瘤菌(*Rhizobium trifolii*)、须腹菌属(*Rhizopogon* spp.)、硬皮锈菌属(*Scleroderma* spp.)、乳牛肝菌属(*Suillus* spp.)、链霉菌属(*Streptomyces* spp.)。

[1071] 用作或可用作生物农药的植物提取物和由微生物形成的产品(包括蛋白和次级代

谢产物)的实例为:

[1072] 大蒜(*Allium sativum*)、苦艾(*Artemisia absinthium*)、印楝素(*azadirachtin*)、Biokeeper WP、*Cassia nigricans*、苦皮藤(*Celastrus angulatus*)、*Chenopodium anthelminticum*、壳多糖(chitin)、*Armour-Zen*、鳞毛蕨(*Dryopteris filix-mas*)、问荆(*Equisetum arvense*)、*Fortune Aza*、*Fungastop*、*Heads Up*(奎奴亚藜(*Chenopodium quinoa*)皂苷提取物)、除虫菊/除虫菊酯类、苏里南苦木(*Quassia amara*)、栎树属(*Quercus*)、皂树属(*Quillaja*)、*Regalia*、“*Requiem*TM*Insecticide*”、鱼藤酮(rotenone)、鱼尼丁/兰尼碱、聚合草(*Symphytum officinale*)、艾菊(*Tanacetum vulgare*)、麝香草酚(thymol)、*Triact 70*、*TriCon*、旱金莲(*Tropaeolum majus*)、大荨麻(*Urtica dioica*)、*Veratrin*、槲寄生(*Viscum album*)、十字花科(*Brassicaceae*)提取物,特别是油籽油菜粉末或芥末粉末。

[1073] 作为混合组分的安全剂

[1074] 式(I)的化合物可与安全剂结合,例如解草酮(benoxacor)、喹氧乙酸(解草酯)(cloquintocet(-mexyl))、解草胺腈(cyometrinil)、环丙磺酰胺(cyprosulphamide)、二氯丙烯胺(dichlormid)、解草唑(fenclorazole(-ethyl))、解草啶(fenclorim)、解草安(flurazole)、氟草肟(fluxofenim)、解草噁唑(furilazole)、双苯噁唑酸(乙酯)(isoxadifen(-ethyl))、吡唑解草酯(mefenpyr(-diethyl))、萘二甲酸酐(naphthalic anhydride)、解草腈(oxabetrinil)、2-甲氧基-N-{4-[(甲基氨基甲酰基) 氨基] 苯基} 磺酰基) 苯甲酰胺(CAS129531-12-0)、4-(二氯乙酰基)-1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷(CAS 71526-07-3)、2,2,5-三甲基-3-(二氯乙酰基)-1,3-噁唑烷(CAS 52836-31-4)。

[1075] 植物和植物部位

[1076] 所有的植物和植物部位均可根据本发明进行处理。在本文中植物理解为意指所有植物和植物种群,例如期望和不期望的野生植物或作物植物(包括天然存在的作物植物),例如谷物(小麦、稻、黑小麦、大麦、黑麦、燕麦)、玉米、大豆、马铃薯、糖用甜菜、甘蔗、西红柿、甜柿子椒和辣椒、黄瓜、甜瓜、胡萝卜、西瓜、洋葱、莴苣、菠菜、韭、豆类、甘蓝(如包菜)和其他蔬菜品种,棉花、烟草、油籽油菜,以及水果植物(有以下水果:苹果、梨、柑橘类水果和葡萄)。作物植物可以为通过常规的育种和优化方法或者通过生物技术方法和基因工程方法或这些方法的组合获得的植物,包括转基因植物以及包括受植物育种者的权利(plant breeders' right)保护或不受其保护的植物栽培种。植物应当理解为意指植物的所有发育阶段,例如种子、插条和早期(未成熟)植物直至成熟植物。植物部位应当理解为意指植物的地上和地下的所有部位和器官,如芽、叶、花和根,给出的实例为叶、针叶、茎、干、花、子实体、果实和种子、以及根、块茎和根茎。植物部位还包括采收的材料(收获植物或植物部分)以及无性和有性繁殖的材料,例如插条、块茎、根茎、分蘖(slip)和种子。

[1077] 根据本发明,使用式(I)的化合物处理植物和植物部位可通过常规处理方法直接进行或使所述化合物作用于其环境、生境或储存空间来进行,例如通过浸渍、喷雾、蒸发、雾化、撒播、涂抹、注射,以及在繁殖材料、尤其是种子的情况下,还可通过施用一层或多层包衣来进行。

[1078] 如上所述,可根据本发明处理所有植物及其部位。在一个优选的实施方案中,处理野生植物物种和植物栽培种,或通过常规生物育种方法如杂交或原生质体融合而获得的那

些,及其部位。在另一优选的实施方案中,处理通过基因工程—如果合适的话可与常规方法结合—获得的转基因植物和植物栽培种(基因修饰生物)及其部位。术语“部位”或“植物的部位”或“植物部位”已在上文中解释。特别优选的是,可根据本发明处理相应的市售常规植物栽培种或正在使用的那些植物。植物栽培种理解为意指具有新特性(“性状”)的并且其已通过常规育种、通过诱变或通过重组DNA技术种植。它们可以是栽培种、变种、生物型或基因型。

[1079] 转基因植物、种子处理和整合事件(integration events)

[1080] 根据本发明进行处理的优选的转基因植物或植物栽培种(通过基因工程获得的植物)包括通过基因修饰接受了赋予这些植物特别有利的有用特性(“性状”)的基因材料的所有植物。这些特性的实例为:更好的植物生长、对高温或低温的增强的耐受性、对干旱或对水或土壤盐度水平的增强的耐受性、提高的开花性能、更容易采收、加速成熟、更高的采收率、采收产品的更高的品质和/或更高的营养价值、采收产品的更长的储存寿命和/或可加工性。这些特性的其他和特别强调的实例为:增强植物对动物害虫和微生物害虫的抗性,例如昆虫、蛛形纲动物、线虫、螨虫、蛞蝓以及蜗牛,例如这归因于在植物中形成的毒素、特别是通过苏云金芽孢杆菌的基因材料(例如通过基因CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb和CryIF及其组合)在植物中产生的那些毒素,以及植物对植物病原性真菌、细菌和/或病毒增强的抗性,其例如由通过体系获得性抗性(SAR)、体系素、植物抗毒素、诱导子和抗性基因及相应的表达蛋白和毒素引起,以及植物对特定除草活性化合物的提高的耐受性,例如咪唑啉酮类、磺酰脲类、草甘膦或膦丝菌素(phosphinothricin)(例如“PAT”基因)。赋予了所讨论的所需特性(“性状”)的基因还可互相结合地存在于转基因植物中。所提及的转基因植物的实例包括重要的作物植物,例如谷物(小麦、稻、黑小麦、大麦、黑麦、燕麦)、玉米、大豆、马铃薯、糖用甜菜、甘蔗、西红柿、豌豆和其他蔬菜品种,棉花、烟草、油籽油菜,以及水果植物(有以下水果:苹果、梨、柑橘类水果和葡萄),特别强调的是玉米、大豆、小麦、稻、马铃薯、棉花、甘蔗、烟草和油籽油菜。特别强调的特性(“性状”)是植物对昆虫、蛛形纲动物、线虫和蛞蝓以及蜗牛的增加的抗性。

[1081] 作物保护——处理的类型

[1082] 用式(I)的化合物对植物和植物部位直接进行处理或通过使用常规处理方法使所述化合物作用于其环境、生境或储存空间来进行处理,所述常规处理方法例如浸渍、喷洒、喷雾、灌溉、蒸发、撒粉、雾化、撒播、发泡、涂抹、撒布、注射、浇水(浇灌)、滴灌,以及在繁殖材料、尤其是种子的情况下,还通过干种子处理、液体种子处理、悬浮液处理、通过结壳、通过用一层或多层包衣包覆等方法进行处理。还可以通过超低容量方法施用式(I)的化合物或者将施用形式或式(I)的化合物本身注射到土壤中。

[1083] 优选的对植物的直接处理为叶面施用,即将式(I)的化合物施用到叶子上,其中处理频率和施用率应根据所述害虫的侵染水平来调整。

[1084] 在内吸性活性化合物的情况下,式(I)的化合物还可以经由根体系进入植物。然后,通过将式(I)的化合物作用于植物的生境来处理该植物。这可以通过例如下述方式完成:浇灌;或者通过混入土壤或营养液中,这意味着植物的生长点(例如土壤或水培体系)被液体形式的式(I)的化合物浸渍;或通过土壤施用,这意味着将式(I)的化合物以固体形式(例如以颗粒的形式)引入到植物的生长点。在水稻作物的情况下,其还可以通过将式(I)的

化合物以固体施用形式(例如作为颗粒)计量加入水稻田来完成。

[1085] 种子处理

[1086] 通过处理植物种子来防治动物害虫长期以来是已知的并且是不断改进的主题。然而,种子处理会产生一系列不能总是以令人满意的方式得以解决的问题。因此,需要开发用于保护种子和发芽作物的方法,该方法不需要或至少显著降低在储存过程中、在播种后或植物出苗后额外施用农药。此外还需要优化所使用的活性化合物的量,以便为种子和发芽植物提供最佳的保护以免受动物害虫的侵害,而所使用的活性化合物则不会损害植物本身。更特别地,用于种子处理的方法还应考虑到抗虫或耐虫的转基因植物的固有的杀虫和/或杀线虫特性,使得用最少量的农药来实现对种子和发芽植物的最佳保护。

[1087] 因此,更特别地,本发明还涉及一种通过用式(I)的化合物之一处理种子来保护种子和发芽植物免受害虫侵害的方法。本发明用于保护种子和发芽植物免受害虫侵害的方法还包括在一个操作中同时或依序用式(I)的化合物和混合组分处理种子的方法。其还包括在不同的时间用式(I)的化合物和混合组分处理种子的方法。

[1088] 本发明还涉及式(I)的化合物用于处理种子以保护种子和所得植物免受动物害虫侵害的用途。

[1089] 本发明还涉及用式(I)的化合物处理过以保护其免受动物害虫侵害的种子。本发明还涉及用式(I)的化合物和混合组分同时处理过的种子。本发明还涉及用式(I)的化合物和混合组分在不同时间处理过的种子。在用式(I)的化合物和混合组分在不同时间处理过的种子的情况下,各物质可存在于该种子的不同层上。在这种情况下,包含式(I)的化合物和混合组分的层可以任选地被中间层隔开。本发明还涉及其中已经施用了作为包衣的部分或作为除了包衣外的其他一层或其他几层的式(I)的化合物和混合组分的种子。

[1090] 本发明还涉及在用式(I)的化合物处理后进行涂膜过程以防止该种子遭受灰尘磨损的种子。

[1091] 使用内吸性的式(I)的化合物的一个优点在于以下事实:通过处理种子,不仅保护种子本身还保护由其得到的植物在出苗后免受动物害虫的侵害。以这种方式,无需在播种时或在其后不久对作物立刻进行处理。

[1092] 另一个优势在于,用式(I)的化合物处理种子可促进经处理的种子发芽和出苗。

[1093] 同样认为有利的是,式(I)的化合物还可尤其用于转基因种子。

[1094] 此外,式(I)的化合物可与信号技术的组分结合使用,其结果是使共生体(例如根瘤菌、菌根和/或内生细菌或真菌)更好的定殖(colonization),和/或优化氮的固定。

[1095] 式(I)的化合物适于保护在农业、温室、林业或园艺中使用的任何植物变种的种子。更具体而言,其包括谷物(例如小麦、大麦、黑麦、粟和燕麦)、玉米、棉花、大豆、稻、马铃薯、向日葵、咖啡、烟草、加拿大油菜、油籽油菜、甜菜(例如糖用甜菜和饲用甜菜)、花生、蔬菜(例如番茄、黄瓜、菜豆、十字花科蔬菜、洋葱和莴苣)、果实植物、草坪植物和观赏性植物的种子。特别重要的是处理谷物(小麦、大麦、黑麦、燕麦)、玉米、大豆、棉花、加拿大油菜、油籽油菜、蔬菜和稻的种子。

[1096] 如上所述,用式(I)的化合物处理转基因种子也是特别重要的。其包括通常包含至少一种异源基因的植物的种子,所述异源基因控制特别是具有杀虫和/或杀线虫特性的多肽的表达。在这种情况下,转基因种子中的异源基因可来自微生物如芽孢杆菌属

(*Bacillus*)、根瘤菌属(*Rhizobium*)、假单孢菌属(*Pseudomonas*)、沙雷氏菌属(*Serratia*)、木霉属(*Trichoderma*)、棒形杆菌属(*Clavibacter*)、球囊霉属(*Glomus*)或粘帚霉属(*Gliocladium*)。本发明特别适合用于处理包含至少一种源自芽孢杆菌属的异源基因的转基因种子。所述异源基因更优选源自苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*)。

[1097] 在本发明的上下文中,将式(I)的化合物施用于种子。优选在这样的状态下处理种子:其足够稳定以使得在处理过程中不发生损害。一般而言,种子可在采收和播种之间的任意时间点处理。通常使用已从植物分离并且已除去穗轴、壳、茎、荚、毛或果肉的种子。因此,例如,可使用已采收、清洁并干燥至允许贮存的水分含量的种子。或者,也可使用在干燥之后例如再经水处理,然后再经干燥(例如引发(priming))的种子。在水稻种子的情况下,例如,也可以使用已经浸泡在水中至某一阶段(鸡胸(pigeon breast)阶段)的种子,这使得发芽改善和出芽更均匀。

[1098] 通常,在处理种子时,必须确保选择施用于种子的式(I)的化合物和/或其他添加剂的量,不损害种子的发芽,或不损害由其所得的植物。特别是活性化合物在特定施用率下可表现出植物毒性效应的情况下,必须保证这点。

[1099] 通常,将式(I)的化合物以合适的制剂形式施用于种子。处理种子的合适的制剂和方法为本领域技术人员已知。

[1100] 式(I)的化合物可被转化为常规的拌种制剂,例如溶液剂、乳剂、悬浮剂、粉剂、泡沫剂、浆剂(slurry)或其他种子包衣组合物,以及ULV制剂。

[1101] 这些制剂用已知方法通过式(I)的化合物与常规添加剂(例如常规增量剂以及溶剂或稀释剂、着色剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、消泡剂、防腐剂、二次增稠剂、粘合剂、赤霉素以及水)进行混合而制备。

[1102] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的着色剂为常用于此目的的所有着色剂。也可使用微溶于水的颜料或可溶于水的染料。实例包括已知的名称为罗丹明B(Rhodamine B)、C.I.颜料红112和C.I.溶剂红1的染料。

[1103] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的有用的润湿剂为促进润湿并通常用于农业化学活性化合物制剂中的所有物质。优选使用萘磺酸烷基酯,如萘磺酸二异丙酯或萘磺酸二异丁酯。

[1104] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的合适的分散剂和/或乳化剂为常用于农业化学活性成分制剂中的所有非离子、阴离子和阳离子分散剂。优选使用非离子或阴离子分散剂,或者非离子或阴离子分散剂的混合物。合适的非离子分散剂特别地包括环氧乙烷/环氧丙烷嵌段聚合物、烷基酚聚乙二醇醚和三苯乙烯基苯酚聚乙二醇醚,以及其磷酸化或硫酸化衍生物。合适的阴离子分散剂特别为木素磺酸盐、聚丙烯酸盐和芳基磺酸盐/甲醛缩合物。

[1105] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的消泡剂为常用于活性农业化学成分制剂中的所有抑制泡沫物质。优选使用硅酮消泡剂和硬脂酸镁。

[1106] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的防腐剂为可用于此目的的农业化学组合物中的所有物质。实例包括双氯酚和苄醇半缩甲醛。

[1107] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的二次增稠剂为可用于此目的的农业化学组合物中的所有物质。优选纤维素衍生物、丙烯酸衍生物、黄原胶、改性粘土以及细分

散二氧化硅。

[1108] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的有用粘合剂为可用于拌种产品的所有常见粘结剂。优选的实例包括聚乙烯基吡咯烷酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇和甲基纤维素。

[1109] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的赤霉素优选为赤霉素A1、A3(=赤霉酸)、A4和A7;特别优选使用赤霉酸。所述赤霉素是已知的(参见R.Wegler“Chemie der Pflanzenschutz- and **Schädlingsbekämpfungsmittel**”第2卷, Springer Verlag, 1970,第401-412页)。

[1110] 可根据本发明使用的拌种制剂可以直接使用或预先用水稀释后使用,以处理多种不同类型的种子。例如,通过用水稀释而可由其获得的浓缩物或制剂可用于谷类(例如小麦、大麦、黑麦、燕麦和黑小麦)种子,以及玉米、稻、油菜、豌豆、豆类、棉花、向日葵、大豆和甜菜种子,或宽范围的不同蔬菜种子的拌种。可根据本发明使用的拌种制剂或其稀释使用形式也可用于转基因植物种子的拌种。

[1111] 对于用可根据本发明使用的拌种制剂或由其制得的使用形式来处理种子,所有常用于拌种的混合单元都是有用的。具体而言,拌种中的步骤为将种子置于间歇操作或连续操作的混合器中;加入特定所需量的拌种制剂(以其本身或预先用水稀释后);然后进行混合直到制剂均匀地分布在种子上。如果合适,之后进行干燥操作。

[1112] 可根据本发明使用的拌种制剂的施用率可在相对宽的范围内变化。这由制剂中式(I)的化合物的特定含量以及种子决定。式(I)的化合物的施用率通常为0.001至50g/千克种子,优选0.01至15g/千克种子。

[1113] 动物健康

[1114] 在动物健康领域,即在兽医学领域,式(I)的化合物对于动物寄生虫、特别是外寄生虫或内寄生虫是有活性的。术语“内寄生虫”特别包括蠕虫纲和原生动物,如球虫目(coccidia)。外寄生虫通常且优选为节肢动物,尤其是昆虫和蜱类。

[1115] 在兽医学领域中,具有有利的温血动物毒性的式(I)的化合物适合于在家畜、繁育动物、动物园动物、实验室动物、实验动物和家养动物中防治在动物繁育和动物畜牧中出现的寄生虫。它们对寄生虫发育的所有或特定阶段有活性。

[1116] 农业家畜包括,例如,哺乳动物,如绵羊、山羊、马、驴、骆驼、水牛、兔、驯鹿、扁角鹿,尤其是牛和猪;或家禽如火鸡、鸭、鹅,尤其是鸡;鱼或甲壳动物如在水产养殖中;以及昆虫如蜜蜂。

[1117] 家养动物包括,例如,哺乳动物,如仓鼠、豚鼠、大鼠、小鼠、毛丝鼠、雪貂,特别是狗、猫、笼鸟、爬行动物、两栖动物和观赏鱼。

[1118] 在一个优选实施方案中,将式(I)的化合物施用于哺乳动物。

[1119] 在另一个优选的实施方案中,将式(I)的化合物施用于禽类,即笼鸟,特别是家禽。

[1120] 使用式(I)的化合物来防治动物寄生虫,旨在减少或预防疾病、死亡病例和性能下降(在肉、奶、毛、皮、蛋、蜜等的情况下),从而使得动物饲养更经济且更简单,并可实现更好的动物健康。

[1121] 关于动物健康领域,术语“防治”(control或controlling)意指式(I)的化合物有效地将在被这样的寄生虫感染的动物中的特定寄生虫的发生率降低至无害水平。更具体而

言,本文中所用的“防治”意指式(I)的化合物有效地杀死各种寄生虫、抑制其生长或抑制其增殖。

[1122] 节肢动物包括:

[1123] 虱目(Anoplurida),例如血虱属种(*Haematopinus* spp.)、毛虱属种(*Linognathus* spp.)、虱属种(*Pediculus* spp.)、Phtirus属种、管虱属种(*Solenopotes* spp.);食毛目(Mallophagida)和钝角亚目(Amblycerina)和丝角亚目(Ischnocerina),例如毛羽虱属种(*Trimenopon* spp.)、禽虱属种(*Menopon* spp.)、巨羽虱属种(*Trinoton* spp.)、牛羽虱属种(*Bovicola* spp.)、*Werneckiella*属种、*Lepikentron*属种、畜虱属种(*Damalina* spp.)、嚼虱属种(*Trichodectes* spp.)、猫虱属种(*Felicola* spp.);双翅目(Diptera)和长角亚目(Nematocerina)和短角亚目(Brachycerina),例如伊蚊属种(*Aedes* spp.)、按蚊属种(*Anopheles* spp.)、库蚊属种(*Culex* spp.)、蚋属种(*Simulium* spp.)、真蚋属种(*Eusimulium* spp.)、白蛉属种(*Phlebotomus* spp.)、罗蛉属种(*Lutzomyia* spp.)、库蠓属种(*Culicoides* spp.)、斑虻属种(*Chrysops* spp.)、短蚋属种(*Odagmia* spp.)、维蚋属种(*Wilhelmia* spp.)、瘤虻属种(*Hybomitra* spp.)、黄虻属种(*Atylotus* spp.)、虻属种(*Tabanus* spp.)、麻虻属种(*Haematopota* spp.)、*Philipomyia*属种、蜂虱蝇属种(*Braula* spp.)、家蝇属种(*Musca* spp.)、齿股蝇属种(*Hydrotaea* spp.)、螫蝇属种(*Stomoxys* spp.)、角蝇属种(*Haematobia* spp.)、莫蝇属种(*Morellia* spp.)、厕蝇属种(*Fannia* spp.)、舌蝇属种(*Glossina* spp.)、丽蝇属种(*Calliphora* spp.)、绿蝇属种(*Lucilia* spp.)、金蝇属种(*Chrysomya* spp.)、污蝇属种(*Wohlfahrtia* spp.)、麻蝇属种(*Sarcophaga* spp.)、狂蝇属种(*Oestrus* spp.)、皮蝇属种(*Hypoderma* spp.)、胃蝇属种(*Gasterophilus* spp.)、虱蝇属种(*Hippobosca* spp.)、羊虱蝇属种(*Lipoptena* spp.)、婢蝇属种(*Melophagus* spp.)、鼻狂蝇属种(*Rhinoestrus* spp.)、大蚊属种(*Tipula* spp.);蚤目(Siphonapterida),例如蚤属种(*Pulex* spp.)、栉头蚤属种(*Ctenocephalides* spp.)、潜蚤属种(*Tunga* spp.)、客蚤属种(*Xenopsylla* spp.)、角叶蚤属种(*Ceratophyllus* spp.);

[1124] 异翅目(Heteroptera),例如臭虫属种(*Cimex* spp.)、锥蝽属种(*Triatoma* spp.)、红猎蝽属种(*Rhodnius* spp.)、攀锥蝽属种(*Panstrongylus* spp.);以及来自蜚蠊目(Blattarida)的公害和卫生害虫。

[1125] 节肢动物还包括:

[1126] 蜱螨亚纲(Acari)(Acarina)和后气门目(Metastigmata),例如软蜱科(Argasidae)如锐缘蜱属种(*Argas* spp.)、钝缘蜱属种(*Ornithodoros* spp.)、残喙蜱属种(*Otobius* spp.)、硬蜱科(Ixodidae)如硬蜱属种(*Ixodes* spp.)、花蜱属种(*Amblyomma* spp.)、扇头蜱属种(*Rhipicephalus*)(牛蜱属种(*Boophilus* spp.))、革蜱属种(*Dermacentor* spp.)、血蜱属种(*Haemophysalis* spp.)、璃眼蜱属种(*Hyalomma* spp.)、扇头蜱属种(*Rhipicephalus* spp.) (多宿主蜱的原属种);中气门目(Mesostigmata)如皮刺螨属种(*Dermanyssus* spp.)、禽刺螨属种(*Ornithonyssus* spp.)、肺刺螨属种(*Pneumonyssus* spp.)、刺利螨属种(*Raillietia* spp.)、肺刺螨属种(*Pneumonyssus* spp.)、胸刺螨属种(*Sternostoma* spp.)、蜂螨属种(*Varroa* spp.)、蜂盾螨属种(*Acarapis* spp.);辐螨目(Actinedida)(前气门目(Prostigmata)),例如蜂盾螨属种(*Acarapis* spp.)、姬螯螨属种(*Cheyletiella* spp.)、禽螯螨属种(*Ornithocheyletia* spp.)、肉螨属种(*Myobia* spp.)、

疮螨属种 (*Psorergates* spp.)、蠕形螨属种 (*Demodex* spp.)、恙螨属种 (*Trombicula* spp.)、*Neotrombiculla* 属种、*Listrophorus* 属种; 和粉螨目 (*Acaridida*) (无气门目 (*Astigmata*)), 例如粉螨属种 (*Acarus* spp.)、食酪螨属种 (*Tyrophagus* spp.)、嗜木螨属种 (*Caloglyphus* spp.)、颈下螨属种 (*Hypodectes* spp.)、翅螨属种 (*Pterolichus* spp.)、痒螨属种 (*Psoroptes* spp.)、皮螨属种 (*Chorioptes* spp.)、耳疥螨属种 (*Otodectes* spp.)、疥螨属种 (*Sarcoptes* spp.)、耳螨属种 (*Notoedres* spp.)、鸟疥螨属种 (*Knemidocoptes* spp.)、气囊螨属种 (*Cytodites* spp.)、鸡雏螨属种 (*Laminosioptes* spp.)。

[1127] 寄生性原生动物包括:

[1128] 鞭毛纲 (*Mastigophora* (*Flagellata*)), 例如, 锥虫科 (*Trypanosomatidae*), 例如, 布氏锥虫 (*Trypanosoma b. brucei*)、布氏冈比亚锥虫 (*T. b. gambiense*)、罗德森锥虫 (*T. b. rhodesiense*)、布氏罗得西亚锥虫 (*T. congolense*)、克鲁兹锥虫 (*T. cruzi*)、伊氏锥虫 (*T. evansi*)、马锥虫 (*T. equinum*)、路易斯锥虫 (*T. lewisi*)、鲈鱼锥虫 (*T. percae*)、猿猴锥虫 (*T. simiae*)、活跃锥虫 (*T. vivax*)、巴西利什曼原虫 (*Leishmania brasiliensis*)、多氏利什曼原虫 (*L. donovani*)、热带利什曼原虫 (*L. tropica*), 例如毛滴虫科 (*Trichomonadidae*), 例如兰伯贾第鞭毛虫 (*Giardia lamblia*)、犬贾第鞭毛虫 (*G. canis*)。

[1129] 肉鞭毛虫亚门 (*Sarcomastigophora*) (根足总纲 (*Rhizopoda*)), 例如内阿米巴科 (*Entamoebidae*), 例如痢疾内阿米巴 (*Entamoeba histolytica*)、哈氏虫科 (*Hartmanellidae*), 例如棘变形虫属种 (*Acanthamoeba* sp.)、哈氏虫属种 (*Harmanella* sp.)。

[1130] 顶复亚门 (*Apicomplexa*) (孢子纲 (*Sporozoa*)), 例如艾美虫科 (*Eimeridae*), 例如堆形艾美虫 (*Eimeria acervulina*)、腺样艾美虫 (*E. adenoides*)、阿拉巴马艾美虫 (*E. alabamensis*)、鸭艾美虫 (*E. anatis*)、鹅艾美虫 (*E. anserina*)、阿氏艾美虫 (*E. arloingi*)、阿洛尼氏艾美虫 (*E. ashata*)、奥本艾美虫 (*E. auburnensis*)、牛艾美虫 (*E. bovis*)、布氏艾美虫 (*E. brunetti*)、犬艾美虫 (*E. canis*)、美栗鼠艾美虫 (*E. chinchillae*)、鱼艾美虫 (*E. clupearum*)、鸽艾美虫 (*E. columbae*)、*E. contorta*、槌状艾美虫 (*E. crandalis*)、德氏艾美虫 (*E. debliciecki*)、散布艾美虫 (*E. dispersa*)、椭圆艾美虫 (*E. ellipsoidales*)、镰刀形艾美虫 (*E. falciformis*)、福氏艾美虫 (*E. faurei*)、黄色艾美虫 (*E. flavescens*)、孔雀艾美虫 (*E. gallopavonis*)、哈氏艾美虫 (*E. hagani*)、肠艾美虫 (*E. intestinalis*)、*E. iroquoina*、无残艾美虫 (*E. irresidua*)、唇艾美虫 (*E. labbeana*)、勒氏艾美虫 (*E. leucarti*)、大型艾美虫 (*E. magna*)、巨型艾美虫 (*E. maxima*)、中型艾美虫 (*E. media*)、珠鸡艾美虫 (*E. meleagridis*)、火鸡和缓艾美虫 (*E. meleagrimitis*)、和缓艾美虫 (*E. mitis*)、毒害艾美虫 (*E. necatrix*)、雅氏艾美虫 (*E. ninakohlyakimovae*)、羊艾美虫 (*E. ovis*)、小型艾美虫 (*E. parva*)、孔雀艾美虫 (*E. pavonis*)、穿孔艾美虫 (*E. perforans*)、*E. phasani*、梨形艾美虫 (*E. piriformis*)、早熟艾美虫 (*E. praecox*)、*E. residua*、粗糙艾美虫 (*E. scabra*)、*E. spec.*、斯氏艾美虫 (*E. stiedai*)、猪艾美虫 (*E. suis*)、禽艾美虫 (*E. tenella*)、树艾美虫 (*E. truncata*)、特鲁特艾美虫 (*E. truttae*)、邱氏艾美虫 (*E. zuernii*)、格洛虫属种 (*Globidium spec.*)、贝氏等孢球虫 (*Isospora belli*)、犬等孢球虫 (*I. canis*)、猫等孢球虫 (*I. felis*)、俄亥俄等孢球虫 (*I. ohioensis*)、芮氏等孢球虫 (*I. rivolta*)、等孢球虫属种 (*I. spec.*)、猪等孢球虫 (*I. suis*)、囊等孢虫属种

(*Cystispora spec.*)、隐孢子虫属种(*Cryptosporidium spec.*),特别是*C.parvum*;例如弓形虫科(*Toxoplasmodidae*),例如鼠弓形虫(*Toxoplasma gondii*)、*Hammondia heydornii*、*Neospora caninum*、贝斯虫(*Besnoitia besnoitii*);例如肉孢子虫科(*Sarcocystidae*),例如牛犬肉孢子虫(*Sarcocystis bovicanis*)、牛人肉孢子虫(*S.bovihominis*)、羊犬肉孢子虫(*S.ovicanis*)、羊猫肉孢子虫(*S.ovifelis*)、*S.neurona*、肉孢子虫属种(*S.spec.*)、猪人肉孢子虫(*S.suihominis*)例如*Leucozoidae*,例如*Leucozytozoon simondi*,例如症原虫科(*Plasmodiidae*),例如伯氏鼠症原虫(*Plasmodium berghei*)、镰状症原虫(*P.falciparum*)、三日症原虫(*P.malariae*)、卵形症原虫(*P.ovale*)、间日症原虫(*P.vivax*),症原虫属种(*P.spec.*),例如焦虫纲(*Piroplasma*),例如阿根廷巴贝虫(*Babesia argentina*)、牛巴贝虫(*B.bovis*)、犬巴贝虫(*B.canis*)、巴贝虫属种(*B.spec.*)、泰勒原虫(*Theileria parva*),泰勒虫属种(*Theileria spec.*),例如匿虫亚目(*Adeleina*),例如犬肝簇虫(*Hepatozoon canis*)、肝簇虫属种(*H.spec.*)。

[1131] 病原性内寄生虫,其为蠕虫纲(helminth),包括扁形动物(例如单殖亚纲(*Monogenea*)、绦虫(*Cestode*)和吸虫类(*Trematode*))、线虫类、棘头虫纲(*Acanthocephala*)和舌形动物门(*Pentastoma*),包括:

[1132] 单殖亚纲:例如三代虫属种(*Gyrodactylus spp.*)、指环虫(*Dactylogyrus spp.*)、多盘吸虫属种(*Polystoma spp.*)。

[1133] 绦虫:假叶目(*Pseudophyllidea*),例如:裂头绦虫属种(*Diphyllobothrium spp.*)、迭宫绦虫属种(*Spirometra spp.*)、裂头属种(*Schistocephalus spp.*)、舌状绦虫属种(*Ligula spp.*)、吸叶绦虫属种(*Bothridium spp.*)、复殖孔属种(*Diplogonoporus spp.*);

[1134] 圆叶目(*Cyclophyllidea*),例如:中殖孔绦虫属种(*Mesocestoides spp.*)、拟裸头绦虫属种(*Anoplocephala spp.*)、副裸头绦虫属种(*Paranoplocephala spp.*)、蒙尼绦虫属种(*Moniezia spp.*)、*Thysanosoma*属种、曲子宫绦虫属种(*Thysaniezia spp.*)、无卵黄腺绦虫属种(*Avitellina spp.*)、西里西亚绦虫属种(*Stilesia spp.*)、锡带绦虫属种(*Cittotaenia spp.*)、*Andyra*属种、伯特绦虫属种(*Bertiella spp.*)、带绦虫属种(*Taenia spp.*)、棘球绦虫属种(*Echinococcus spp.*)、泡尾绦虫属种(*Hydatigera spp.*)、戴维绦虫属种(*Davainea spp.*)、瑞利绦虫属种(*Raillietina spp.*)、膜壳绦虫属种(*Hymenolepis spp.*)、棘鳞绦虫属种(*Echinolepis spp.*)、棘叶绦虫属种(*Echinocotyle spp.*)、双睾绦虫属种(*Diorchis spp.*)、犬复孔绦虫属种(*Dipylidium spp.*)、约优克斯绦虫属种(*Joyeuxiella spp.*)、复孔绦虫属种(*Diplopylidium spp.*);

[1135] 吸虫:选自复殖亚纲(*Digenea*),例如:双穴吸虫属种(*Diplostomum spp.*)、茎双穴吸虫属种(*Posthodiplostomum spp.*)、血吸虫属种(*Schistosoma spp.*)、毛毕吸虫属种(*Trichobilharzia spp.*)、鸟毕吸虫属种(*Ornithobilharzia spp.*)、澳毕吸虫属种(*Austrobilharzia spp.*)、巨毕吸虫属种(*Gigantobilharzia spp.*)、彩蚴吸虫属种(*Leucochloridium spp.*)、短咽吸虫属种(*Brachylaima spp.*)、棘口吸虫属种(*Echinostoma spp.*)、棘缘吸虫属种(*Echinoparyphium spp.*)、棘隙吸虫属种(*Echinochasmus spp.*)、低颈吸虫属种(*Hypoderaeum spp.*)、片形吸虫属种(*Fasciola spp.*)、片形吸虫属种(*Fascioloides spp.*)、姜片吸虫属种(*Fasciolopsis spp.*)、环腔吸

虫属种 (*Cyclocoelum* spp.)、盲腔吸虫属种 (*Typhlocoelum* spp.)、同盘吸虫属种 (*Paramphistomum* spp.)、杯殖吸虫属种 (*Calicophoron* spp.)、殖盘吸虫属种 (*Cotylophoron* spp.)、巨盘吸虫属种 (*Gigantoctyle* spp.)、菲策吸虫 (*Fischoederius* spp.)、腹袋吸虫属种 (*Gastrothylacus* spp.)、背孔吸虫属种 (*Notocotylus* spp.)、下弯吸虫属种 (*Catatropis* spp.)、斜睾吸虫属种 (*Plagiorchis* spp.)、前殖吸虫属种 (*Prosthogonimus* spp.)、双腔吸虫属种 (*Dicrocoelium* spp.)、阔盘吸虫属种 (*Eurytoma* spp.)、鲑吸虫属种 (*Troglorema* spp.)、并殖吸虫属种 (*Paragonimus* spp.)、肛瘤吸虫属种 (*Collyriclum* spp.)、小叶吸虫属种 (*Nanophyetus* spp.)、后睾吸虫属种 (*Opisthorchis* spp.)、支睾吸虫属种 (*Clonorchis* spp.)、次睾吸虫属种 (*Metorchis* spp.)、异形吸虫属种 (*Heterophyes* spp.)、后殖吸虫属种 (*Metagonimus* spp.)；

[1136] 线虫:毛线科 (*Trichinellida*)，例如:鞭虫属种 (*Trichuris* spp.)、毛细线虫属种 (*Capillaria* spp.)、*Paracapillaria*属种、真鞘属种 (*Eucoleus* spp.)、*Trichomosoides*属种、旋毛虫属种 (*Trichinella* spp.)；

[1137] 垫刃目 (*Tylenchida*)，例如:细丝鲶属种 (*Micronema* spp.)、粪圆线虫属种 (*Strongyloides* spp.)；

[1138] 杆形目 (*Rhabditina*)，例如:圆线虫属种 (*Strongylus* spp.)、三齿属种 (*Triodontophorus* spp.)、食道齿属种 (*Oesophagodontus* spp.)、毛线属种 (*Trichonema* spp.)、辐首属种 (*Gyalocephalus* spp.)、柱咽属种 (*Cylindropharynx* spp.)、孟口属种 (*Poteriostomum* spp.)、*Cyclococercus*属种、杯冠属种 (*Cylicostephanus* spp.)、食道口属种 (*Oesophagostomum* spp.)、夏伯特线虫属种 (*Chabertia* spp.)、冠尾属种 (*Stephanurus* spp.)、钩虫属种 (*Ancylostoma* spp.)、弯口属种 (*Uncinaria* spp.)、板口线虫属种 (*Necator* spp.)、仰口线虫属种 (*Bunostomum* spp.)、球首属种 (*Globocephalus* spp.)、比翼属种 (*Syngamus* spp.)、*Cyathostoma*属种、后圆线虫属种 (*Metastrongylus* spp.)、网尾线虫属种 (*Dictyocaulus* spp.)、缪勒线虫属种 (*Muellerius* spp.)、原圆线虫属种 (*Protostrongylus* spp.)、新圆线虫属种 (*Neoststrongylus* spp.)、囊尾线虫属种 (*Cystocaulus* spp.)、肺圆属种 (*Pneumoststrongylus* spp.)、*Spicocaulus*属种、鹿圆线虫属种 (*Elaphoststrongylus* spp.)、副鹿圆线虫属种 (*Parelaphoststrongylus* spp.)、环体线虫属种 (*Crenosoma* spp.)、*Paracrenosoma*属种、奥斯勒线虫属种 (*Oslerus* spp.)、血管圆线虫属种 (*Angiostrongylus* spp.)、猫圆线虫属种 (*Aelurostrongylus* spp.)、类丝虫属种 (*Filaroides* spp.)、*Parafilaroides*属种、毛圆线虫属种 (*Trichostrongylus* spp.)、血矛线虫属种 (*Haemonchus* spp.)、奥斯特线虫属种 (*Ostertagia* spp.)、背带线虫属种 (*Teladorsagia* spp.)、马歇尔线虫属种 (*Marshallagia* spp.)、古柏线虫属种 (*Cooperia* spp.)、日圆线虫属种 (*Nippostrongylus* spp.)、螺旋线虫属种 (*Heligmosomoides* spp.)、细颈线虫属种 (*Nematodirus* spp.)、猪圆线虫属种 (*Hyoststrongylus* spp.)、*Obeliscoides*属种、裂口线虫属种 (*Amidostomum* spp.)、盘头线虫属种 (*Ollulanus* spp.)；

[1139] 旋尾目 (*Spirurida*)，例如:尖尾线虫属种 (*Oxyuris* spp.)、蛲虫属种 (*Enterobius* spp.)、栓尾线虫属种 (*Passalurus* spp.)、管状线虫属种 (*Syphacia* spp.)、无刺属种 (*Aspicularis* spp.)、异刺线虫属种 (*Heterakis* spp.)；蛔虫属种 (*Ascaris* spp.)、弓蛔虫属种 (*Toxascaris* spp.)、弓首线虫属种 (*Toxocara* spp.)、贝蛔虫属种 (*Baylisascaris*

spp.)、副蛔虫属种 (*Parascaris* spp.)、异尖线虫属种 (*Anisakis* spp.)、禽蛔虫属种 (*Ascaridia* spp.)；颚口线虫属种 (*Gnathostoma* spp.)、泡翼线虫属种 (*Physaloptera* spp.)、吸吮线虫属种 (*Thelazia* spp.)、筒线虫属种 (*Gongylonema* spp.)、柔线虫属种 (*Habronema* spp.)、副柔线属种 (*Parabronema* spp.)、*Draschia*属种、龙线虫属种 (*Dracunculus* spp.)；冠丝虫属种 (*Stephanofilaria* spp.)、副丝虫属种 (*Parafilaria* spp.)、腹腔丝虫属种 (*Setaria* spp.)、罗阿线虫属种 (*Loa* spp.)、恶丝虫属种 (*Dirofilaria* spp.)、类平滑丝虫属种 (*Litomosoides* spp.)、布鲁线虫属种 (*Brugia* spp.)、吴策线虫属种 (*Wuchereria* spp.)、盘尾丝虫属种 (*Onchocerca* spp.)、尾旋线虫属种 (*Spirocerca* spp.)；

[1140] 棘头虫纲 (*Acanthocephala*)：寡棘吻目 (*Oligacanthorhynchida*)，例如：巨吻丝虫属种 (*Macracanthorhynchus* spp.)、前睾丝虫种 (*Prosthenorchis* spp.)；多形目 (*Polymorphida*)，例如：细颈丝虫属种 (*Filicollis* spp.)；念珠属种 (*Moniliformida*)，例如：念珠丝虫属种 (*Moniliformis* spp.)；

[1141] 棘吻目 (*Echinorhynchida*)，例如，棘头虫属种 (*Acanthocephalus* spp.)、鱼棘头虫属种 (*Echinorhynchus* spp.)、鳞棘头虫属种 (*Leptorhynchoides* spp.)；

[1142] 舌形动物门 (*Pentastoma*)：舌形虫目 (*Porocephalida*)，例如舌形虫属种 (*Linguatula* spp.)。

[1143] 在兽医领域和动物饲养中，通过本领域已知的一般方法，例如肠内、胃肠外、真皮或经鼻途径以合适制剂的形式施用式 (I) 的化合物。可预防性地或治疗性地进行施用。

[1144] 因此，本发明的一个实施方案涉及式 (I) 的化合物作为药物的用途。

[1145] 另一个方面是指式 (I) 的化合物作为抗体内寄生虫剂，尤其为杀蠕虫剂 (*helminthocidal agent*) 或抗原生动物剂的用途。式 (I) 的化合物适合例如在动物畜牧业中，在动物繁育中、在动物圈养中和在卫生领域中用作抗体内寄生虫剂、尤其是杀蠕虫剂或抗原生动物剂。

[1146] 另一个方面涉及式 (I) 的化合物作为抗体外寄生虫剂，尤其为杀节肢动物例如杀虫剂或杀螨剂的用途。另一个方面涉及式 (I) 的化合物例如在动物畜牧业中、在动物繁育中、在动物圈养中或在卫生领域中作为抗体外寄生虫剂，尤其为杀节肢动物例如杀虫剂或杀螨剂的用途。

[1147] 抗蠕虫混合组分

[1148] 以下的抗蠕虫混合组分可以通过举例的方式被提及：

[1149] 包括杀吸虫 (*trematocidally*) 和杀绦虫 (*cestocidally*) 活性化合物的抗蠕虫活性化合物：

[1150] 大环内酯类的抗蠕虫活性化合物，例如：阿维菌素、多拉菌素、依马菌素、依立诺克丁、伊维菌素、米尔倍霉素、莫昔克丁、奈马克丁、司拉克丁；

[1151] 苯并咪唑类和苯并咪唑前体类的抗蠕虫活性化合物，例如：阿苯达唑、阿苯达唑亚砷、坎苯达唑、环苯达唑、非班太尔、芬苯达唑、氟苯咪唑、甲苯咪唑、奈托比胺、奥芬达唑、奥苯达唑、帕苯达唑、噻苯哒唑、托布津、三氯苯达唑；

[1152] *Cyclooctadepsipeptides*类的抗蠕虫活性化合物，例如：依吗德塞 (*emodepside*)、PF 1022；

- [1153] 氨基乙腈衍生物类的抗蠕虫活性化合物,例如:莫奈太尔;
- [1154] 四氢嘧啶类的抗蠕虫活性化合物,例如:莫仑太尔、噻吡啶、奥克太尔;
- [1155] 咪唑并噻唑类的抗蠕虫活性化合物,例如:布他咪唑、左旋咪唑、四咪唑;
- [1156] 水杨酰苯胺类的抗蠕虫活性化合物,例如:溴沙尼特、溴替尼特、氯碘沙尼、氯生太尔、氯硝柳胺、羟氯扎胺、雷复尼特、三溴沙仑;
- [1157] paraherquamides类的抗蠕虫活性化合物,例如:德奎太尔、paraherquamide;
- [1158] 氨基苯基酰胺类的抗蠕虫活性化合物,例如:阿米太尔、脱酰化阿米太尔(dAMD)三苯双脒;
- [1159] 有机磷酸酯类的抗蠕虫活性化合物,例如:库马磷、克芦磷酯、敌敌畏、haloxone、naphthalofos、敌百虫;
- [1160] 取代酚类的抗蠕虫活性化合物,例如:硫氯酚、二碘硝酚、六氯酚、联硝氯酚、meniclopholan、硝羟碘苄脒;
- [1161] 哌嗪酮类的抗蠕虫活性化合物,例如:吡嗪酮、依西太尔;
- [1162] 各种其它类的抗蠕虫活性化合物,例如:硝硫氰胺、酚乙胺、丁萘脒、氯硝西洋、氯舒隆、地芬尼泰、双氯酚、乙胺嗪、依米丁、三氯苯哌嗪、海恩酮、硫蒽酮、竹桃霉素、mirasan、氯硝柳胺、尼立达唑、硝碘酚脒、硝硫氰酯、奥替普拉、omphalotin、奥沙尼嗪、巴龙霉素、哌嗪、雷琐太尔。
- [1163] 病媒防治
- [1164] 式(I)的化合物还可用于病媒防治。在本发明的上下文中,病媒为节肢动物,尤其是昆虫或蛛形纲动物,其能够将病原体例如病毒、蠕虫、单细胞生物和细菌,从贮主(植物、动物、人等)传播给宿主。所述病原体可以机械地传播给宿主(例如通过无刺蝇(non-stinging)传播沙眼),或者可以在注射后传播给宿主(例如通过蚊子传播疟原虫)。
- [1165] 病媒以及它们传播的疾病或病原体的实例为:
- [1166] 1) 蚊(Mosquitoes)
- [1167] -按蚊属:疟疾、丝虫病;
- [1168] -库蚊属:日本脑炎、丝虫病、其他病毒性疾病、蠕虫传播;
- [1169] -伊蚊属:黄热病、登革热、丝虫病、其他病毒性疾病;
- [1170] -蚋科:蠕虫传播,特别是盘尾丝虫(*Onchocerca volvulus*);
- [1171] 2) 虱:皮肤感染、流行性斑疹伤寒(epidemic typhus);
- [1172] 3) 跳蚤:鼠疫、地方性斑疹伤寒;
- [1173] 4) 蝇:昏睡病(锥虫病(trypansomiasis))、霍乱、其他细菌性疾病;
- [1174] 5) 螨:壁虱病、流行性斑疹伤寒、立克次氏体痘、土拉菌病、圣路易斯脑炎(Saint Louis encephalitis)、蜱媒脑炎(tick-borne encephalitis)(TBE)、克里米亚-刚果出血热(Crimean-Congo haemorrhagic fever)、疏螺旋体病(borreliosis);
- [1175] 6) 蜱:borellioses,如达氏疏螺旋体(*Borrelia duttoni*)、蜱媒脑炎、Q热(贝氏柯克斯体(*Coxiella burnetii*))、焦虫病(babesioses)(犬巴贝斯虫(*Babesia canis canis*))。
- [1176] 在本发明的上下文中,病媒的实例为昆虫,例如蚜虫、蝇、叶蝉或蓟马(thrip),其可向植物传播植物病毒。能够传播植物病毒的其他病媒是蛛状螨、虱、甲虫和线虫。

[1177] 在本发明的上下文中,病媒的其他实例为昆虫和蛛形纲动物,例如蚊,尤其是伊蚊属、按蚊属的蚊类,例如冈比亚按蚊 (*A.gambiae*)、阿拉伯按蚊 (*A.arabiensis*)、不吉按蚊 (*A.funestus*)、大劣按蚊 (*A.dirus*) (疟疾);以及库蚊属蚊子、虱、跳蚤、蝇、螨和蜱,其可向动物和/或人类传播病原体。

[1178] 如果式 (I) 的化合物为抗性突破 (resistance-breaking) 的,则病媒防治也是可能的。

[1179] 式 (I) 的化合物适合用于预防由病媒传播的疾病和/或病原体。因此,本发明的另一方面为式 (I) 的化合物在例如农业、园艺、林业、园林以及休闲设备中、以及在材料和贮存产品的保护中用以病媒防治的用途。

[1180] 工业材料的保护

[1181] 式 (I) 的化合物适合用于保护工业材料免受昆虫的侵害或破坏,例如来自鞘翅目、膜翅目、等翅目、鳞翅目、啮虫目和衣鱼目 (*Zygentoma*) 的昆虫的侵害或破坏。

[1182] 在本发明的上下文中,工业材料应理解为意指无生命材料,例如,优选塑料、粘合剂、胶料、纸和纸片、皮革、木材及加工的木制品和涂层组合物。特别优选本发明用于保护木材的用途。

[1183] 在另一个实施方案中,式 (I) 的化合物与至少一种其他杀虫剂和/或至少一种杀真菌剂一起使用。

[1184] 在另一实施方案中,式 (I) 的化合物以即用型 (ready-to-use) 农药的形式存在,即意味着它不需要其他修饰即可应用到所讨论的材料上。合适的其他杀虫剂或杀真菌剂特别是上述提及的杀虫剂或杀真菌剂。

[1185] 出人意料地,还发现式 (I) 的化合物可用于保护与盐水或微咸水接触的物体免受污染,尤其是船体、筛、网、建筑物、系泊设备及信号体系。同样可以将式 (I) 的化合物单独或与其他活性化合物结合用作防污剂。

[1186] 卫生领域中动物害虫的防治

[1187] 式 (I) 的化合物适合用于防治卫生领域的动物害虫。更具体而言,本发明可以用于家用保护领域、卫生保护领域以及储存产品的保护中,特别是用于防治密闭空间中遇到的昆虫、蛛形纲动物和螨虫,所述密闭空间为例如住所、工厂车间、办公室、车辆舱室。为了防治动物害虫,式 (I) 的化合物可单独或其他活性化合物和/或助剂结合使用。它们优选用于家用的杀虫剂产品中。式 (I) 的化合物对敏感的及抗性物种以及对全部发育阶段均有效。

[1188] 这些害虫包括,例如,下述的害虫:蛛形纲,蝎目 (*Scorpiones*)、蜘蛛目 (*Araneae*) 和盲蛛目 (*Opiliones*);唇足纲和倍足纲;昆虫纲蜚蠊目、鞘翅目、革翅目、双翅目、异翅亚目、膜翅目、等翅目、鳞翅目、虱目 (*Phthiraptera*)、啮虫目、跳跃目 (*Saltatoria*) 或直翅目、蚤目和衣鱼目;软甲亚纲等足目。

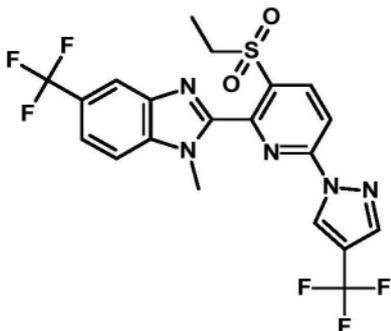
[1189] 施用以下列形式进行:气雾剂、无压喷雾产品如泵式喷雾剂和雾化喷雾剂、自动起雾体系、喷雾剂、泡沫剂、凝胶剂、具有由纤维素或塑料制成的蒸发片剂 (evaporator tablet) 的蒸发产品、液体蒸发剂、凝胶和薄膜蒸发剂、螺旋桨式蒸发器、无动力 (energy-free) 或无源 (passive) 的蒸发体系、捕蛾纸、捕蛾袋和捕蛾胶,作为颗粒剂或粉剂,用于撒播的诱饵或诱饵站 (bait station) 中。

[1190] 制备实施例:

[1191] 实施例I-1

[1192] 2- {3- (乙基磺酰基) -6- [4- (三氟甲基) -1H-吡唑-1-基]吡啶-2-基} -1-甲基-5- (三氟甲基) -1H-苯并咪唑

[1193]



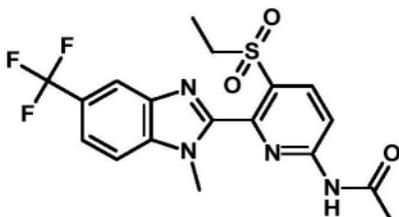
[1194] 将55mg 2- [3- (乙基磺酰基) -6- 氟吡啶-2-基] -1-甲基-5- (三氟甲基) -1H-苯并咪唑 (0.14mmol) 溶于2mL乙腈中。加入29mg (0.21mmol) 4- (三氟甲基) -1H-吡唑和59mg (0.42mmol) 碳酸钾, 在室温下搅拌3h。将混合物过滤、浓缩并通过柱色谱法用环己烷/乙酸乙酯梯度作为流动相进行纯化。

[1195] $\log P$ (中性): 4.16; MH^+ : 504; ^1H-NMR (400MHz, D_6-DMSO) δ_{ppm} : 9.38 (s, 1H), 8.712 (d, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.42 (d, 1H), 8.16 (s, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.70 (dd, 1H), 3.906 (q, 2H), 3.90 (s, 3H), 1.24 (t, 3H)。

[1196] 实施例I-2

[1197] N- {5- (乙基磺酰基) -6- [1-甲基-5- (三氟甲基) -1H-苯并咪唑-2-基]吡啶-2-基} 乙酰胺

[1198]



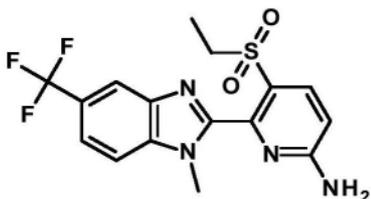
[1199] 将50mg (0.13mmol, 1当量) 5- (乙基磺酰基) -6- [1-甲基-5- (三氟甲基) -1H-苯并咪唑-2-基]吡啶-2-胺溶于1mL甲苯和1mL吡啶的混合物中。加入16mg (0.13mmol, 1当量) 4-二甲氨基吡啶和30mg (0.39mmol, 3当量) 乙酰氯, 将该混合物在100°C下加热1h。冷却至室温后, 浓缩反应混合物并通过柱色谱法用环己烷/乙酸乙酯梯度作为流动相进行纯化。

[1200] ($\log P$ (中性): 2.5; MH^+ : 427; ^1H-NMR (400MHz, D_6-DMSO) δ_{ppm} : 11.26 (s, 1H), 8.48 (m, 2H), 8.12 (s, 1H), 7.93 (d, 1H), 7.72 (d, 1H), 3.76 (s, 3H), 3.69 (q, 2H), 2.17 (s, 3H), 1.17 (t, 3H))。

[1201] 实施例I-3

[1202] 5- (乙基磺酰基) -6- [1-甲基-5- (三氟甲基) -1H-苯并咪唑-2-基]吡啶-2-胺

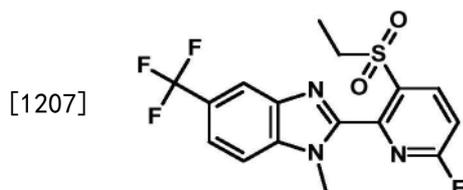
[1203]



[1204] 将400mg 2-[3-(乙基磺酰基)-6-氟吡啶-2-基]-1-甲基-5-(三氟甲基)-1H-苯并咪唑(1.03mmol, 1当量)溶于2mL乙醇中,加入1.33g氨溶液(水溶液, 33%, 25.8mmol, 25当量)。在搅拌下,将该混合物在微波中在100℃下加热1h。冷却至室温后,浓缩溶液并通过柱色谱法(流动相:环己烷/乙酸乙酯梯度)纯化。

[1205] ($\log P$ (中性): 2.18; MH^+ : 385; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 8.07 (s, 1H), 7.91 (m, 2H), 7.68 (d, 1H), 7.36 (s, 1H), 6.74 (d, 2H), 3.71 (s, 3H), 3.51 (q, 2H), 1.13 (t, 3H)。

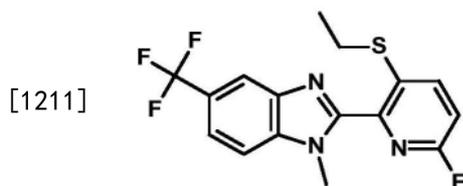
[1206] 2-[3-(乙基磺酰基)-6-氟吡啶-2-基]-1-甲基-5-(三氟甲基)-1H-苯并咪唑(实施例XIII-1)



[1208] 将80mg (0.21mmol) 2-[3-(乙基硫基)-6-氟吡啶-2-基]-1-甲基-5-(三氟甲基)-1H-苯并咪唑在室温下溶于10mL二氯甲烷中。加入49mg (1.06mmol) 甲酸和0.13mL 35%过氧化氢水溶液(1.49mmol)。在室温下搅拌4h后(TLC对照:转化完全),加入1mL水,然后缓慢加入2mL 40%亚硫酸氢钠溶液以终止反应。搅拌混合物1h,然后分离各相。将水相用二氯甲烷萃取三次,然后将合并的有机萃取物用饱和 $NaHCO_3$ 溶液洗涤。有机相用 $MgSO_4$ 干燥,过滤并减压除去溶剂。

[1209] $\log P$ (中性): 2.96; MH^+ : 388; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 8.69 (m, 1H), 8.14 (s, 1H), 7.94 (d, 1H), 7.75 (m, 2H), 3.83 (q, 2H), 3.81 (s, 3H), 1.21 (t, 3H)。

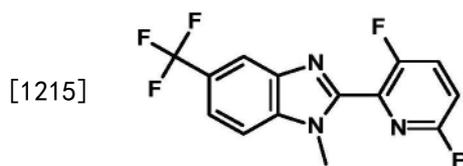
[1210] 2-[3-(乙基硫基)-6-氟吡啶-2-基]-1-甲基-5-(三氟甲基)-1H-苯并咪唑(实施例XI-1)



[1212] 将500mg (1.34mmol) 2-(3,6-二氟吡啶-2-基)-1-甲基-5-(三氟甲基)-1H-苯并咪唑溶于5mL无水THF中并冷却至-10℃。加入56mg (60%, 1.39mmol) NaH,在搅拌下将混合物加热至室温。非常缓慢地滴加溶于3mL无水THF中的91mg (1.47mmol) 乙硫醇,并将混合物在室温下搅拌3h。将反应混合物用乙酸乙酯稀释并用饱和NaCl溶液洗涤两次。干燥有机相后,将其减压浓缩并将残余物通过柱色谱法(流动相:环己烷/乙酸乙酯梯度)纯化。

[1213] ($\log P$ (中性): 3.44; MH^+ : 356; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 7.66 (dd, 1H), 7.61 (dt, 1H), 7.56 (dd, 1H), 7.52 (dd, 1H), 4.26 (q, 2H), 3.44 (s, 3H), 1.29 (t, 3H)。

[1214] 2-(3,6-二氟吡啶-2-基)-1-甲基-5-(三氟甲基)-1H-苯并咪唑(实施例IX-1)

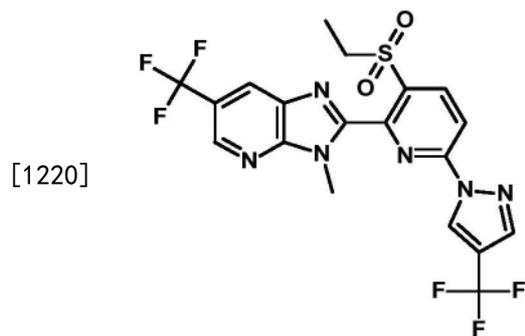


[1216] 在氩气下,将5.00g (26.2mmol) N1-甲基-4-(三氟甲基)苯-1,2-二胺溶于107mL无水吡啶中,加入4.18g (26.2mmol) 3,6-二氟吡啶-2-甲酸和5.04g (26.2mmol) N-(3-二甲氨基丙基)-N'-乙基碳化二亚胺盐酸盐。将混合物在120℃下搅拌9h。冷却至室温后,将混合物减压浓缩,然后用乙酸乙酯稀释。有机相用水洗涤,用MgSO₄干燥并减压浓缩。产物可以在甲基叔丁基醚中进行重结晶而部分纯化。

[1217] (logP(中性): 2.83; MH⁺: 314; ¹H-NMR (400MHz, D₆-DMSO) δppm: 8.26 (m, 1H), 8.16 (s, 1H), 7.93 (d, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.57 (m, 1H), 4.02 (s, 3H)。

[1218] 实施例I-4

[1219] 2-{3-(乙基磺酰基)-6-[4-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]吡啶-2-基}-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶

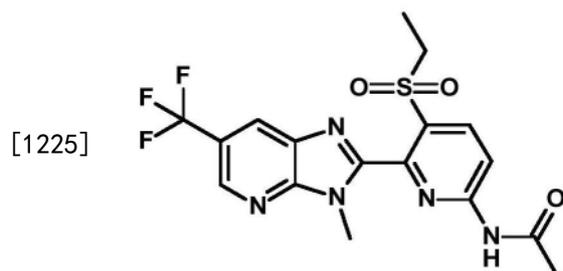


[1221] 化合物2-{3-(乙基磺酰基)-6-[4-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]吡啶-2-基}-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶也可以按照上述用于制备2-{3-(乙基磺酰基)-6-[4-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]吡啶-2-基}-1-甲基-5-(三氟甲基)-1H-苯并咪唑的方法来制备。

[1222] (logP(中性): ; 4.04; MH⁺: 505; ¹H-NMR (400MHz, D₆-DMSO) δppm: 9.42 (s, 1H), 8.94 (s, 1H), 8.73 (m, 2H), 8.45 (m, 2H), 3.91 (m, 5H), 1.25 (t, 3H)

[1223] 实施例I-5

[1224] N-{5-(乙基磺酰基)-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-2-基}乙酰胺

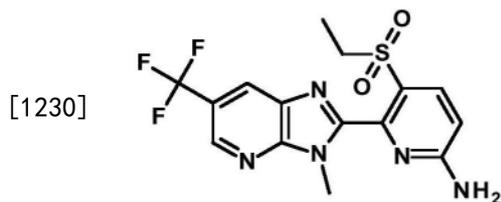


[1226] 化合物N-{5-(乙基磺酰基)-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]乙酰胺也可以按照上述用于制备N-{5-(乙基磺酰基)-6-[1-甲基-5-(三氟甲基)-1H-苯并咪唑-2-基]吡啶-2-基}乙酰胺的方法来制备。

[1227] (logP(中性): 2.3; MH⁺: 428; ¹H-NMR (400MHz, D₆-DMSO) δppm: 11.29 (s, 1H), 8.89 (s, 1H), 8.68 (s, 1H), 8.51 (q, 2H), 3.78 (s, 3H), 3.66 (q, 2H), 2.17 (s, 3H), 1.18 (t, 3H)。

[1228] 实施例I-6

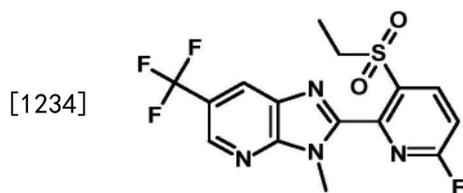
[1229] 5-(乙基磺酰基)-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-2-胺



[1231] 5-(乙基磺酰基)-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-2-胺也可以按照上述用于制备5-(乙基磺酰基)-6-[1-甲基-5-(三氟甲基)-1H-苯并咪唑-2-基]吡啶-2-胺的方法来制备。

[1232] ($\log P$ (中性): 2.02; MH^+ : 386; 1H -NMR(400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 8.84(s, 1H), 8.61(s, 1H), 7.93(d, 1H), 7.42(b-s, 1H), 6.76(d, 1H), 3.73(s, 3H), 3.49(q, 2H); 1.14(t, 3H)。

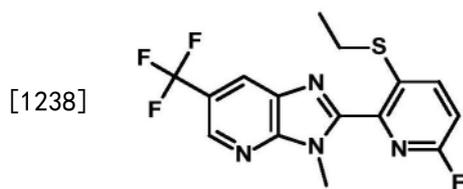
[1233] 2-[3-(乙基磺酰基)-6-氟吡啶-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶(实施例XIII-2)



[1235] 2-[3-(乙基磺酰基)-6-氟吡啶-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶也可以按照上述用于制备2-[3-(乙基磺酰基)-6-氟吡啶-2-基]-1-甲基-5-(三氟甲基)-1H-苯并咪唑的方法来制备。

[1236] ($\log P$ (中性): 2.80; MH^+ : 389; 1H -NMR(400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 8.91(m, 1H), 8.70(m, 2H), 7.81(dd, 1H), 3.82(m, 5H), 1.22(t, 3H)。

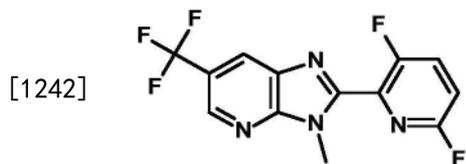
[1237] 2-[3-(乙基硫基)-6-氟吡啶-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶(实施例XI-2)



[1239] 化合物2-[3-(乙基硫基)-6-氟吡啶-2-基]-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶也可以按照上述用于制备2-[3-(乙基硫基)-6-氟吡啶-2-基]-1-甲基-5-(三氟甲基)-1H-苯并咪唑的方法来制备。

[1240] ($\log P$ (中性): 3.45; MH^+ : 357; 1H -NMR(400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 8.87(s, 1H), 8.68(m, 1H), 8.29(m, 1H), 7.49(dd, 1H), 3.94(s, 3H), 3.01(q, 2H), 1.19(t, 3H)。

[1241] 2-(3,6-二氟吡啶-2-基)-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶(实施例IX-2)

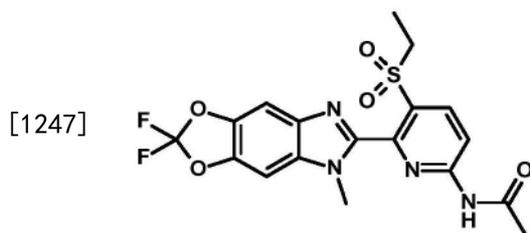


[1243] 2-(3,6-二氟吡啶-2-基)-3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶也可按照上述用于制备2-(3,6-二氟吡啶-2-基)-1-甲基-5-(三氟甲基)-1H-苯并咪唑的方法来制备。

[1244] ($\log P$ (中性): 2.72; MH^+ : 315; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 8.88 (m, 1H), 8.70 (m, 1H), 8.29 (m, 1H), 7.60 (m, 1H), 4.07 (s, 3H)。

[1245] 实施例I-7

[1246] N-[6-(2,2-二氟-7-甲基-[1,3]间二氧杂环戊烯并[4,5-f]苯并咪唑-6-基)-5-乙基磺酰基-2-吡啶基]乙酰胺

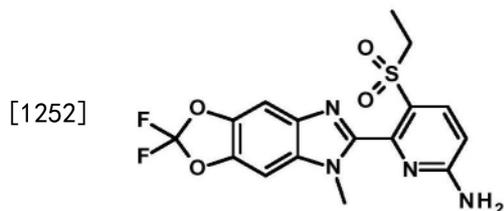


[1248] 将35mg (0.08mmol) 6-(2,2-二氟-7-甲基-[1,3]间二氧杂环戊烯并[4,5-f]苯并咪唑-6-基)-5-乙基磺酰基吡啶-2-胺溶于2mL甲苯和2mL吡啶的混合物中,加入10.8mg 4-二甲氨基吡啶(0.08mmol),然后将混合物与21.0mg (0.26mmol) 乙酰氯混合。将混合物在100℃下搅拌45min,然后减压蒸馏除去溶剂。残余物通过柱色谱法用二氯甲烷/乙酸乙酯梯度(100:0;50:50;0:100)作为流动相进行纯化。

[1249] ($\log P$ (中性): 2.42; MH^+ : 439; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1.16 (t, 3H), 2.16 (s, 1H), 3.69 (q, 2H), 3.70 (s, 3H), 7.77 (s, 1H), 7.87 (s, 1H), 8.44 (m, 2H), 11.23 (s, 1H)。

[1250] 实施例I-8

[1251] 6-(2,2-二氟-7-甲基-[1,3]间二氧杂环戊烯并[4,5-f]苯并咪唑-6-基)-5-乙基磺酰基吡啶-2-胺



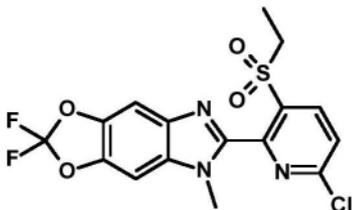
[1253] 将105mg (0.25mmol) 6-(6-氯-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-2,2-二氟-7-甲基-[1,3]间二氧杂环戊烯并[4,5-f]苯并咪唑与3mL乙醇和3mL26%浓度的氨水溶液在微波中在120℃和12bar下搅拌2h。将混合物在减压下除去溶剂,残余物通过柱色谱法经制备型HPLC使用水/乙腈梯度作为流动相纯化。

[1254] ($\log P$ (中性): 2.10; MH^+ : 397; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1.13 (t, 3H), 3.53 (q, 2H), 3.65 (s, 3H), 6.70 (d, 1H), 7.30 (br. s., 2H), 7.72 (s, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.90 (d, 1H)。

[1255] 6-(6-氯-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-2,2-二氟-7-甲基-[1,3]间二氧杂环戊烯并

[4,5-f]苯并咪唑(实施例XIII-3)

[1256]

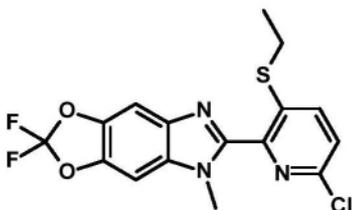


[1257] 将334mg (0.84mmol) 6-(6-氯-3-乙基硫基-2-吡啶基)-2,2-二氟-7-甲基-[1,3]间二氧杂环戊烯并[4,5-f]苯并咪唑溶于20mL二氯甲烷中,在室温下加入195.3mg (4.24mmol)甲酸和577.2mg (5.93mmol) 35%浓度的过氧化氢,然后将混合物在室温下搅拌6h。将混合物再次与117.2mg (2.54mmol)甲酸混合,并将混合物在室温下搅拌1h。用水稀释反应混合物并与亚硫酸氢钠溶液混合,搅拌1h,然后与饱和碳酸氢钠溶液混合。分离有机相,将水相用二氯甲烷萃取两次,然后将合并的有机相减压除去溶剂。

[1258] ($\log P$ (中性): 3.20; MH^+ : 416; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1.20 (t, 3H), 3.75 (s, 3H), 3.84 (q, 2H), 7.79 (s, 1H), 7.87 (s, 1H), 8.04 (d, 1H), 8.51 (d, 1H)。

[1259] 6-(6-氯-3-乙基硫基-2-吡啶基)-2,2-二氟-7-甲基-[1,3]间二氧杂环戊烯并[4,5-f]苯并咪唑(实施例XI-3)

[1260]

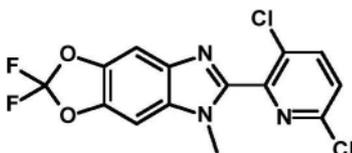


[1261] 将2.37g (6.62mmol) 6-(3,6-二氯-2-吡啶基)-2,2-二氟-7-甲基-[1,3]间二氧杂环戊烯并[4,5-f]苯并咪唑溶于35mL四氢呋喃中,在-5℃下与276mg (6.89mmol)氢化钠混合,将混合物在0℃下搅拌30分钟。然后,在-5℃下在30分钟内滴加453mg (7.28mmol)乙硫醇,除去冷却浴,然后将混合物在室温下搅拌2h。将反应混合物在氩气下用20mL水进行水解,分离有机相,水相用乙酸乙酯萃取两次。合并有机相,用氯化钠溶液洗涤并用硫酸钠干燥,减压蒸馏除去溶剂。残余物通过柱色谱法使用环己烷/乙酸乙酯梯度(20:80至60:40)作为流动相进行纯化。

[1262] ($\log P$ (中性): 3.80; MH^+ : 384; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1.20 (t, 3H), 3.00 (q, 2H), 3.86 (s, 3H), 7.66 (d, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.84 (s, 1H), 8.05 (d, 1H)。

[1263] 6-(3,6-二氯-2-吡啶基)-2,2-二氟-7-甲基-[1,3]间二氧杂环戊烯并[4,5-f]苯并咪唑(实施例IX-3)

[1264]

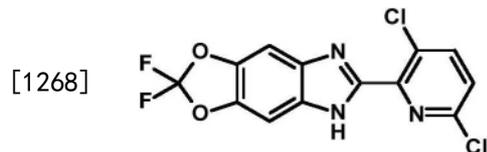


[1265] 将2.7g (7.84mmol) 6-(3,6-二氯-2-吡啶基)-2,2-二氟-5H-[1,3]间二氧杂环戊烯并[4,5-f]苯并咪唑、1.24g (8.63mmol)碘甲烷和2.17g (15.6mmol)碳酸钾溶于丙酮中,并在回流下搅拌6h。过滤反应混合物,将母液除去溶剂,残余物溶于二氯甲烷中,用水洗涤,用硫酸钠干燥,然后减压蒸馏除去溶剂。残余物通过柱色谱法使用环己烷/乙酸乙酯梯度(20:80

至60:40)作为流动相进行纯化。

[1266] ($\log P$ (中性):3.22; MH^+ :358; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm:3.82 (s, 3H), 7.79-7.81 (m, 2H), 7.86 (s, 1H), 8.28 (d, 1H)。

[1267] 6-(3,6-二氯-2-吡啶基)-2,2-二氟-5H-[1,3]间二氧杂环戊烯并[4,5-f]苯并咪唑(实施例IX-4)

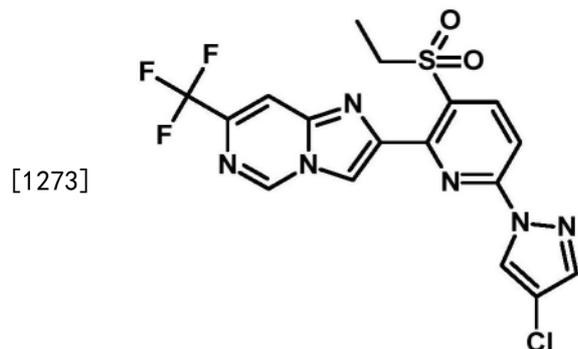


[1269] 在氩气下,将10.02g (50.6mmol) 2,2-二氟-1,3-苯并二氧杂环戊-5,6-二胺、12.27g (63.2mmol) 3,6-二氯吡啶-2-甲酸和9.90g (50.6mmol) 1-(3-二甲氨基丙基)-3-乙基碳二亚胺盐酸盐(EDCI)在100mL吡啶中在120℃下搅拌8h。将反应混合物减压除去溶剂,将残余物溶于乙酸乙酯中并用水洗涤。水相用乙酸乙酯萃取两次,合并有机相,用硫酸钠干燥,然后减压蒸发除去溶剂。残余物通过柱色谱法使用环己烷/乙酸乙酯梯度(20:80至0:100)作为流动相进行纯化。

[1270] ($\log P$ (中性):3.20; MH^+ :344; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm:7.54 (s, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.82 (s, 1H), 8.20 (d, 1H), 13.29 (s, 1H)。

[1271] 实施例I-17

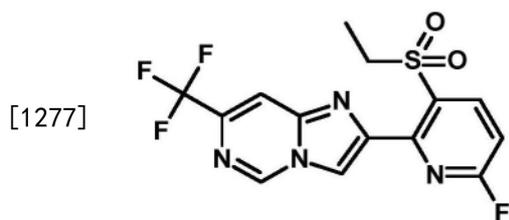
[1272] 2-[6-(4-氯-1H-吡啶-1-基)-3-(乙基磺酰基)吡啶-2-基]-7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶



[1274] 将2-[3-(乙基磺酰基)-6-氟吡啶-2-基]-7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶(49.0mg, 0.13mmol, 1当量)溶于6mL乙腈中。加入碳酸铯(51mg, 0.15mmol, 1.2当量)、碘化钾(10.9mg, 0.06mmol, 0.5当量)和4-氯-1H-吡啶(40.2mg, 0.39mmol, 3当量),并将混合物在75℃下加热3h。冷却至室温后,浓缩反应混合物,将残余物通过色谱法纯化,分离所需异构体(流动相:环己烷,乙酸乙酯)。

[1275] $\log P$ (中性):3.46; MH^+ :457; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm:9.63 (s, 1H), 9.06 (d, 2H), 8.63 (s, 1H), 8.15-8.13 (m, 2H), 4.21-4.16 (q, 2H); 1.28 (t, 3H)。

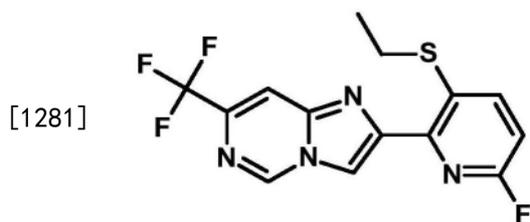
[1276] 2-[3-(乙基磺酰基)-6-氟吡啶-2-基]-7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶(实施例XIII-4)



[1278] 将2-[3-(乙基磺基)-6-氟吡啶-2-基]-7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶(65.0mg, 0.19mmol, 1当量异构体混合物)溶于3mL二氯甲烷中,加入甲酸(5当量, 0.94mmol)和过氧化氢溶液(7当量, 1.32mmol)。将反应混合物在室温下搅拌12h。通过用40%亚硫酸氢钠溶液搅拌(1h)来还原过量的氧化剂。分离各相,有机相用饱和碳酸氢钠溶液洗涤,经硫酸钠干燥并浓缩。残余物通过色谱法纯化并分离所需的产物(流动相:乙酸乙酯/环己烷)。

[1279] MH^+ : 375; ^1H-NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 9.66 (s, 1H); 8.71 (s, 1H), 8.42-8.34 (m, 2H); 7.56-7.53 (m, 1H), 4.13-4.07 (m, 2H), 1.27-1.20 (m, 3H)。

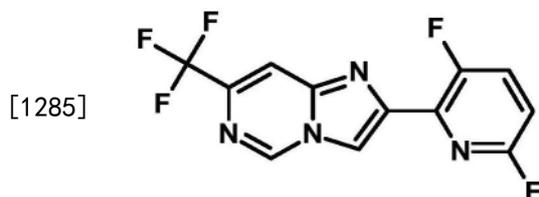
[1280] 2-[3-(乙基磺基)-6-氟吡啶-2-基]-7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶(实施例XI-4)



[1282] 在氩气气氛下,将2-(3,6-二氟吡啶-2-基)-7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶(329mg, 1.09mmol, 1当量)溶于5mL无水二甲基甲酰胺和10mL无水四氢呋喃中。将混合物冷却至-10°C,然后加入氢化钠(45mg, 1.14mmol, 1.04当量)。历时1h,将混合物加热至室温,然后滴加溶于5mL四氢呋喃中的乙硫醇(75mg, 1.2mmol, 1.1当量)。反应2h后,加入饱和氯化钠溶液和乙酸乙酯。分离各相,有机相用饱和氯化钠溶液洗涤,用硫酸钠干燥并在旋转蒸发器上浓缩。残余物通过色谱法(硅胶,流动相:环己烷、乙酸乙酯)进行纯化。

[1283] $\log P$ (中性): 2.78; MH^+ : 343; ^1H-NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 9.64 (s, 1H), 8.72 (s, 1H), 8.33 (s, 1H), 7.26-7.23 (m, 1H), 7.20-7.15 (m, 1H)。

[1284] 2-(3,6-二氟吡啶-2-基)-7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶(实施例IX-5)



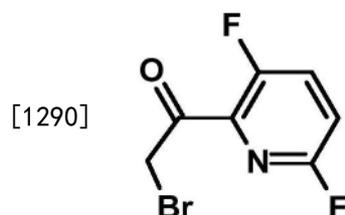
[1286] 将1-(3,6-二氟吡啶-2-基)乙酮(2.0g, 12.7mmol, 1当量)和溴化铜(II)(4.2g, 19.0mmol, 1.5当量)在30mL乙醇中在60°C下加热4h。浓缩反应混合物并将残余物溶于乙酸乙酯中。有机相用饱和氯化铵溶液洗涤两次,用饱和氯化钠溶液洗涤一次,用硫酸钠干燥并浓缩。将粗产物2-溴-1-(3,6-二氟吡啶-2-基)乙酮($\log P$ (中性): 1.93; MH^+ : 236)不经进一步纯化而进一步转化。

[1287] 在第二个反应容器中,将6-(三氟甲基)嘧啶-4-胺(201mg, 1.23mmol, 1当量)和碳

酸氢钠(155mg, 1.85mmol, 1.5当量)溶解或悬浮于3mL氯仿中。滴加溶于1mL氯仿中的2-溴-1-(3,6-二氟吡啶-2-基)乙酮(502mg, 1.23mmol, 1当量), 然后将反应混合物在60°C下加热4h。过滤碳酸氢钠, 浓缩有机相。残余物通过色谱法(硅胶, 流动相: 环己烷/乙酸乙酯)进行纯化。

[1288] $\log P$ (中性): 2.02; MH^+ : 301; 1H -NMR(400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 9.64(s, 1H), 8.77(d, 1H), 8.35(s, 1H), 8.17-8.10(m, 1H), 7.36-7.32(m, 1H)。

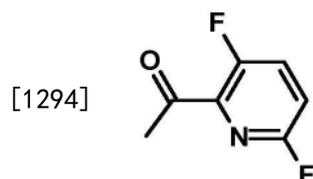
[1289] 2-溴-1-(3,6-二氟吡啶-2-基)乙酮



[1291] 将1-(3,6-二氟吡啶-2-基)乙酮(6.4g, 40.7mmol)溶于96mL乙醇中, 加入溴化铜(II)(13.7g, 61.1mmol)。将反应混合物在60°C下加热4h。冷却至室温后, 在旋转蒸发器上除去溶剂, 将残余物溶于饱和氯化铵溶液并溶于乙酸乙酯。水相用乙酸乙酯萃取两次。合并的有机萃取物用饱和氯化钠溶液洗涤, 用硫酸钠干燥并浓缩。分离的产物为混合物的形式, 其不经进一步纯化而用于随后的反应。

[1292] $\log P$ (中性): 1.95; MH^+ : 2.38; 1H -NMR(400MHz, CDC13) δ ppm: 8.17-8.10(m, 1H), 7.62-7.57(m, 1H), 2.56(s, 2H)。

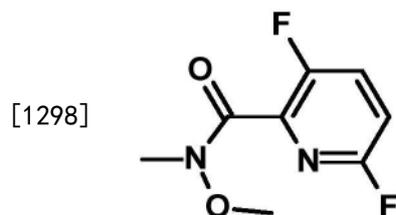
[1293] 1-(3,6-二氟吡啶-2-基)乙酮



[1295] 在氩气气氛下, 将3,6-二氟-N-甲氧基-N-甲基吡啶-2-甲酰胺(10.1g, 50.2mmol)溶于270mL无水THF中并冷却至0°C。缓慢滴加甲基溴化镁(3M的乙醚溶液, 50mL, 150mmol), 然后将混合物在0°C下搅拌2h。为了终止反应, 在冷却下缓慢加入50mL氯化铵溶液。将有机相分离并用饱和氯化钠溶液洗涤。将有机相分离并用饱和氯化钠溶液洗涤。在旋转蒸发器上除去溶剂, 粗产物不经进一步纯化而用于随后的反应中。

[1296] $\log P$ (中性): 1.24; MH^+ : 158; 1H -NMR(400MHz, CDC13) δ ppm: 8.16-8.10(m, 1H), 7.61-7.57(m, 1H), 2.56-2.55(m, 3H)。

[1297] 3,6-二氟-N-甲氧基-N-甲基吡啶-2-甲酰胺



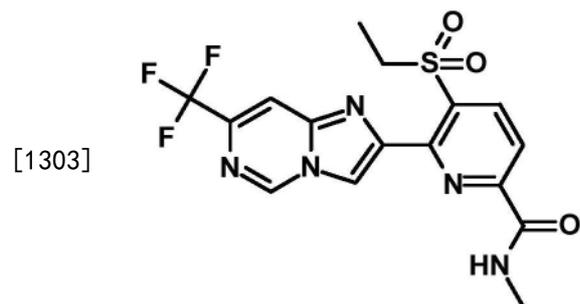
[1299] 将3,6-二氟吡啶-2-甲酸(15g, 94mmol)和N,0-二甲基羟胺盐酸盐(9.1g, 94.2mmol)溶于600mL二氯甲烷中并冷却至0°C。加入4-二甲基氨基吡啶(DMAP, 13.8g,

113mmol)和N-(二甲基氨基丙基)-N'-乙基碳二亚胺盐酸盐(EDCI, 19.9g, 103mmol), 并将反应混合物在0℃下搅拌2h, 然后将反应混合物在室温下搅拌12h。将溶液用饱和碳酸氢钠溶液洗涤一次, 并用饱和氯化钠溶液洗涤一次, 经硫酸钠干燥并浓缩。粗产物不经进一步纯化而用于随后的反应。

[1300] $\log P$ (中性): 1.05; MH^+ : 203; 1H -NMR (400MHz, $CDCl_3$) δ ppm: 8.15-8.09 (m, 1H), 7.44-7.42 (m, 1H), 3.57 (s, 3H), 3.31 (s, 3H)。

[1301] 实施例I-38

[1302] 5-(乙基磺酰基)-N-甲基-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]吡啶-2-甲酰胺



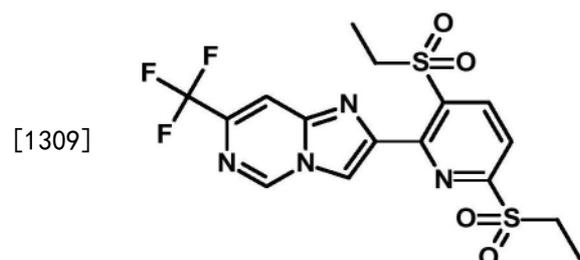
[1304] 将2-[3,6-双(乙基磺酰基)吡啶-2-基]-7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶(135mg, 0.12mmol, 纯度约40%)、乙酸钠(18mg, 0.22mmol)和[1,1'-双(二苯基膦)二茂铁]二氯化钡(II)-丙酮络合物(PD-107; 10mg, 0.01mmol)溶于10mL甲醇中。将反应溶液在10bar下用一氧化碳冲洗, 然后在10bar一氧化碳气氛下在80℃下加热36h。加入另外的乙酸钠(18mg, 0.22mmol)和[1,1'-双(二苯基膦)二茂铁]二氯化钡(II)-丙酮络合物(PD-107; 10mg, 0.01mmol), 将混合物在相同条件下再搅拌21h。

[1305] 浓缩反应溶液并通过色谱法(流动相: 环己烷、乙酸乙酯)纯化。

[1306] 在室温下, 将5-(乙基磺酰基)-6-[7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶-2-基]吡啶-2-羧酸甲酯(125mg, 0.12mmol, 纯度约40%)溶于甲醇和甲胺(33%的乙醇溶液, 113mg, 1.2mmol)中, 并加入0.1mL水。将反应溶液在室温下搅拌20min, 然后浓缩。通过HPLC(乙腈、水、甲酸)进行纯化。

[1307] $\log P$ (酸性): 1.95; MH^+ : 414; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 9.68 (s, 1H), 9.04 (s, 1H), 8.98-8.95 (m, 1H), 8.65-8.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H), 8.27-8.26 (d, 1H), 4.21-4.17 (q, 2H), 2.91-2.90 (d, 3H), 1.28-1.26 (t, 3H)。

[1308] 2-[3,6-二(乙基磺酰基)吡啶-2-基]-7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶(LXXIII-1)



[1310] 在氩气气氛下, 将2-(3,6-二氟吡啶-2-基)-7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶

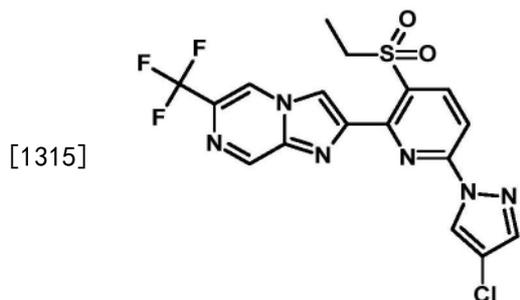
(100mg, 0.33mmol, 1当量)溶于2ml无水DMF中。加入乙硫醇钠(168mg, 1.99mmol, 6当量)并在室温下搅拌12h。混合物用乙酸乙酯稀释并用饱和氯化钠溶液洗涤。将有机相用硫酸钠干燥,并在旋转蒸发器上除去溶剂。粗产物不经进一步纯化即用于随后的反应。

[1311] 将2-[3,6-双(乙基磺基)吡啶-2-基]-7-(三氟甲基)咪唑并[1,2-c]嘧啶(75mg, 0.19mmol, 1当量)溶于9mL二氯甲烷中。在室温下,加入甲酸(90mg, 1.95mmol, 10当量)和过氧化氢溶液(35%, 265mg, 12.7mmol, 14当量),并将混合物搅拌12h。加入1mL水后,缓慢滴加3mL 40%亚硫酸氢钠溶液并搅拌混合物1h。然后分离出有机相,用饱和碳酸氢钠溶液洗涤,用硫酸钠干燥并浓缩。残余物通过色谱法(流动相:环己烷、乙酸乙酯)纯化。

[1312] $\log P$ (中性): 2.28; MH^+ : 449; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 9.67 (s, 1H), 8.86 (s, 1H), 8.82-8.80 (m, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.36-8.34 (m, 1H), 4.23-4.18 (m, 2H), 3.64-3.59 (m, 2H), 1.30-1.23 (m, 6H)。

[1313] 实施例I-18

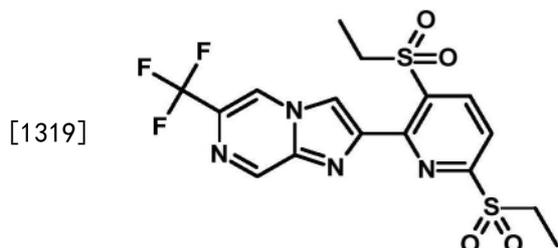
[1314] 2-[6-(4-氯-1H-吡唑-1-基)-3-(乙基磺酰基)吡啶-2-基]-6-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡嗪



[1316] 将2-[3,6-双(乙基磺酰基)吡啶-2-基]-6-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡嗪(88mg, 0.19mmol, 1当量)和4-氯-1H-吡唑(20mg, 0.19mmol, 1当量)溶于2mL乙腈中。加入碳酸铯(77mg, 0.23mmol, 1.2当量)和碘化钾(16mg, 0.09mmol, 0.5当量),并将混合物在室温下搅拌12h。加入一些硅胶后,将反应混合物蒸发至干,然后通过柱色谱法(流动相:环己烷、乙酸乙酯)纯化。

[1317] $\log P$ (中性): 3.44; MH^+ : 457; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 9.34 (ψ -s, 2H), 9.00 (s, 2H), 8.66-8.64 (m, 1H), 8.17-8.14 (m, 2H), 4.18-4.13 (q, 2H), 1.30-1.28 (t, 3H)。

[1318] 2-[3,6-二(乙基磺酰基)吡啶-2-基]-6-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡嗪(实施例LXXIII-2)

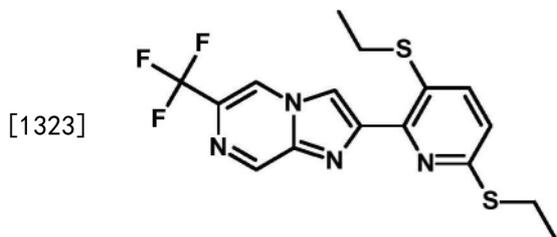


[1320] 将2-[3,6-双(乙基磺基)吡啶-2-基]-6-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡嗪(101mg, 0.26mmol, 1当量)溶于10mL二氯甲烷中。在室温下,加入甲酸(120mg, 2.62mmol, 10当量)和过氧化氢溶液(35%, 3.67mmol, 14当量)。将反应混合物在室温下搅拌12h。然后,加入1mL水并非常缓慢地加入40%亚硫酸氢钠溶液。将混合物在室温下搅拌1h,然后分离各相。有机相

用饱和碳酸氢钠溶液洗涤,用硫酸钠干燥并浓缩。残余物通过柱色谱法(硅胶,流动相环己烷/乙酸乙酯)纯化。

[1321] $\log P$ (中性): 2.23; MH^+ : 449; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 9.40-9.36 (d, 2H), 8.85-8.82 (m, 2H), 8.37-8.35 (d, 2H), 4.21-4.16 (m, 2H), 3.63-3.58 (m, 2H), 1.31-1.23 (m, 6H)。

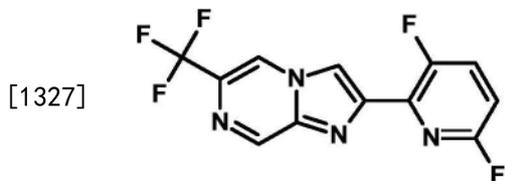
[1322] 2-[3,6-二(乙基硫基)吡啶-2-基]-6-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡嗪(实施例LXXI-1)



[1324] 在氩气气氛下,将2-(3,6-二氟吡啶-2-基)-6-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡嗪(290mg, 0.96mmol, 1当量)悬浮于10mL无水四氢呋喃和10mL无水二甲基甲酰胺中。将悬浮液冷却至 $-10^{\circ}C$,加入氢化钠(60%, 95mg, 2.41mmol, 2.5当量)。在室温下,缓慢滴加乙硫醇(150mg, 2.41mmol, 2.5当量,溶于2mL二甲基甲酰胺中)。将反应混合物在室温下搅拌24h,然后加入饱和氯化钠溶液。用乙酸乙酯稀释混合物,然后分离各相。有机相用饱和氯化钠溶液洗涤,经硫酸钠干燥并浓缩。残余物通过柱色谱法(流动相:环己烷、乙酸乙酯)纯化。

[1325] $\log P$ (中性): 4.00; MH^+ : 385; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 9.40 (s, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.76 (s, 1H), 7.77-7.75 (d, 1H), 7.31-7.29 (d, 1H), 3.20-3.18 (q, 2H), 3.02-2.97 (q, 2H), 1.40-1.34 (t, 3H), 1.27-1.23 (t, 3H)。

[1326] 2-(3,6-二氟吡啶-2-基)-6-(三氟甲基)咪唑并[1,2-a]吡嗪(实施例IX-6)



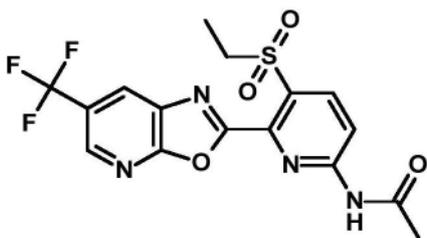
[1328] 将5-(三氟甲基)吡嗪-2-胺(500mg, 3.06mmol, 1当量)和2-溴-1-(3,6-二氟吡啶-2-基)乙酮(1.02g, 3.67mmol, 2当量)溶于15mL乙醇中并在 $60^{\circ}C$ 下加热5天。将反应混合物浓缩并在二氯甲烷/甲基叔丁基醚中重结晶。

[1329] $\log P$ (酸性): 2.05; MH^+ : 301; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 9.39 (s, 1H), 9.31 (s, 1H), 8.80-8.79 (m, 1H), 8.18-8.11 (m, 1H), 7.37-7.33 (m, 1H)。

[1330] 实施例I-19

[1331] N-{5-(乙基磺酰基)-6-[6-(三氟甲基)[1,3]噁唑并[5,4-b]吡啶-2-基]吡啶-2-基}乙酰胺

[1332]

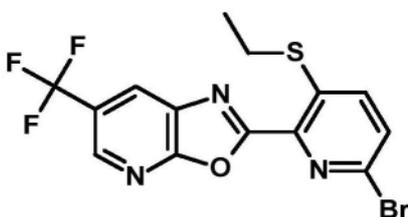


[1333] 根据上述用于制备N- {5- (乙基磺酰基) -6- [3-甲基-6- (三氟甲基) -3H-咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-2-基} 乙酰胺的步骤,同样可通过5- (乙基磺酰基) -6- [6- (三氟甲基) [1,3]噁唑并[5,4-b]吡啶-2-基]吡啶-2-胺作为中间体 (使用粗品) 制备N- {5- (乙基磺酰基) -6- [6- (三氟甲基) [1,3]噁唑并[5,4-b]吡啶-2-基]吡啶-2-基} 乙酰胺。

[1334] $\log P$ (中性): 2.44; ; MH^+ : 415; ^1H-NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 11.45 (s, 1H) , 9.03-9.01 (m, 2H) , 8.56-8.52 (m, 2H) , 3.79-3.75 (m, 2H) , 2.19 (s, 3H) , 1.27-0.91 (m, 3H) 。

[1335] 2- [6-溴-3- (乙基硫基) 吡啶-2-基] -6- (三氟甲基) [1,3]噁唑并[5,4-b]吡啶 (实施例XI-5)

[1336]

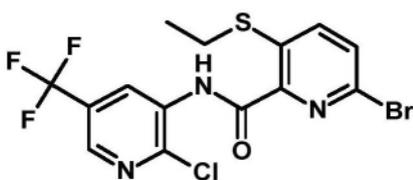


[1337] 将6-溴-N- [2-氯-5- (三氟甲基) 吡啶-3-基] -3- (乙基硫基) 吡啶-2-甲酰胺 (1.2g, 2.72mmol) 和碳酸钠 (288mg, 2.72mmol) 在20mL二甲基甲酰胺中于145°C下搅拌12h。通过加入40mL冰水终止反应,将产物沉淀出来并通过过滤分离出灰色固体。

[1338] $\log P$ (中性): 4.16; ; MH^+ : 404; ^1H-NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 8.97-8.95 (m, 2H) , 8.00-7.86 (m, 2H) , 3.17-3.11 (m, 2H) , 1.35-1.31 (m, 3H) 。

[1339] 6-溴-N- [2-氯-5- (三氟甲基) 吡啶-3-基] -3- (乙基硫基) 吡啶-2-甲酰胺 (实施例LXIX-1)

[1340]

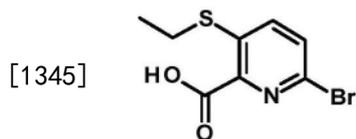


[1341] 将6-溴-3- (乙基硫基) 吡啶-2-甲酸 (3g, 11.5mmol) 溶于60mL二氯甲烷中并冷却至0°C。在搅拌下,加入草酰氯 (14.5g, 115mmol) 和一滴二甲基甲酰胺,然后将混合物在室温下搅拌30min。除去溶剂后,将粗产物6-溴-3- (乙基硫基) 吡啶-2-甲酰氯直接进一步反应。

[1342] 在0°C下,将2-氯-5- (三氟甲基) 吡啶-3-胺 (1.05g, 5.38mmol) 加入到氢化钠 (60%的矿物油, 258mg, 6.46mmol) 的四氢呋喃悬浮液中。将混合物搅拌30min,然后分批加入6-溴-3- (乙基硫基) 吡啶-2-甲酰氯 (3g, 10.75mmol) 。搅拌12h后,通过加入10mL冰水终止反应。通过过滤将产物以沉淀的形式分离出来。

[1343] $\log P$ (中性): 5.27; MH^+ : 442; ^1H-NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 10.57 (s, 1H) ; 8.91 (s, 1H) , 8.70 (s, 1H) , 7.95-7.87 (m, 2H) , 3.05-3.00 (m, 2H) , 1.30-1.27 (m, 3H) 。

[1344] 6-溴-3- (乙基硫基) 吡啶-2-甲酸



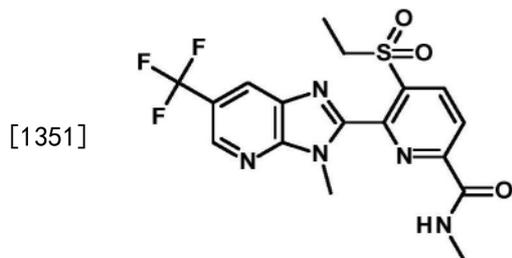
[1346] 将6-溴-3-氟-2-甲基吡啶 (5g, 26.3mmol) 溶于100mL水中, 加入高锰酸钾 (12.5g, 78.9mmol)。将反应混合物加热回流12h。通过过滤除去固体成分。滤饼用100mL水洗涤三次。浓缩收集的洗涤溶液, 得到为白色固体的粗产物, 其直接进行进一步反应。

[1347] 将粗产物 (6g) 溶于20mL二甲基甲酰胺中, 加入乙硫醇钠 (6.6g, 78.9mmol) 后, 将混合物在室温下搅拌12h。过滤反应混合物并浓缩有机相。残余物经层析法 (流动相: 水/乙腈) 纯化, 得到为黄色固体形式的产物。

[1348] $\log P$ (中性): 1.79; MH^+ : 262; ^1H-NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 7.85-7.39 (m, 2H), 3.34-2.92 (m, 2H), 1.39-1.15 (m, 3H)。

[1349] 实施例I-34

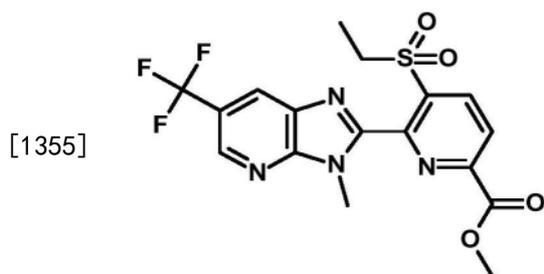
[1350] 5-(乙基磺酰基)-N-甲基-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-2-甲酰胺



[1352] 在室温下, 将5-(乙基磺酰基)-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-2-羧酸甲酯 (50mg, 0.11mmol, 1当量) 溶于甲醇。加入甲胺 (33%的乙醇溶液, 109mg, 1.16mmol, 10当量) 和0.1mL水, 并将混合物在室温下搅拌20min。浓缩反应溶液并通过柱色谱法 (流动相: 环己烷、乙酸乙酯) 纯化。

[1353] $\log P$ (中性): 2.36; MH^+ : 428; ^1H-NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 9.01-8.98 (m, 1H), 8.93-8.92 (m, 1H), 8.73-8.71 (m, 2H), 8.50-8.48 (m, 1H), 3.89-3.84 (m, 5H), 2.84-2.83 (d, 3H), 1.24-1.20 (t, 3H)。

[1354] 5-(乙基磺酰基)-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-2-甲酸甲酯 (实施例LXXX-1)

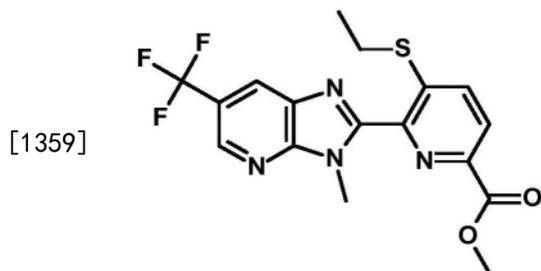


[1356] 将5-(乙基磺基)-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-2-甲酸甲酯 (211mg, 0.53mmol, 1当量) 溶于145mL二氯甲烷中。在室温下, 加入甲酸 (245mg, 5.32mmol, 10当量) 和过氧化氢 (35%的水溶液, 724mg, 7.45mmol, 14当量), 并将反应混合物搅拌12h。在冰冷却下, 缓慢加入2mL水和2mL 40%亚硫酸氢钠溶液, 搅拌混合物1h。分离有

机相,用硫酸钠干燥并浓缩。粗产物通过柱色谱法(流动相:环己烷、乙酸乙酯)纯化。

[1357] $\log P$ (中性):2.61; MH^+ :429; 1H -NMR(400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm:8.93-8.92(m, 1H), 8.76-8.74(m, 1H), 8.72-8.71(m, 1H), 8.54-8.52(m, 1H), 3.96(s, 3H), 3.89-3.82(q, 2H), 3.78(s, 3H), 1.23-1.20(t, 3H)。

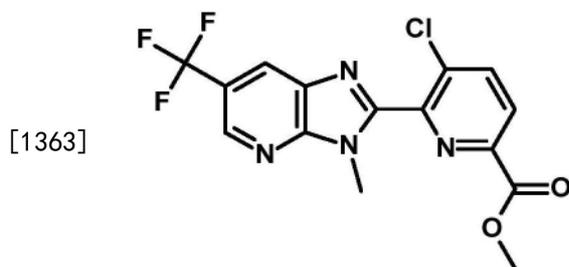
[1358] 5-(乙基硫基)-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-2-甲酸甲酯(实施例LXXIX-1)



[1360] 将5-氯-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-2-甲酸甲酯(200mg, 0.53mmol, 1当量)溶于5mL四氢呋喃中,加入氢化钠(16mg, 0.40mmol, 0.75当量)和乙硫醇钠(47mg, 0.56mmol, 1.05当量)。将反应混合物在室温下搅拌1h,然后将混合物倒入1N盐酸溶液中。加入乙酸乙酯后,分离各相。水相用乙酸乙酯萃取。合并的有机相用饱和氯化钠溶液洗涤,用硫酸钠干燥并浓缩。粗产物不经进一步纯化而进一步反应。

[1361] $\log P$ (中性):3.25; MH^+ :397; 1H -NMR(400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm:8.89-8.88(m, 1H), 8.70-8.67(m, 1H), 8.20-8.15(m, 2H), 4.03(s, 3H), 3.92(s, 3H), 3.13-3.08(m, 2H), 1.29-1.26(t, 3H)。

[1362] 5-氯-6-[3-甲基-6-(三氟甲基)-3H-咪唑并[4,5-b]吡啶-2-基]吡啶-2-甲酸甲酯(实施例LXXVIII-1)



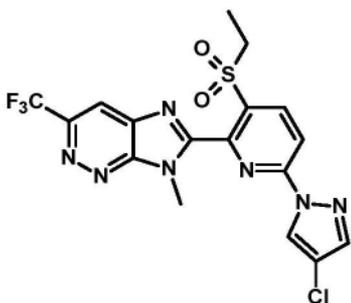
[1364] 将N2-甲基-5-(三氟甲基)吡啶-2,3-二胺(1.5g, 7.84mmol, 1当量)、3-氯-6-(甲氧基羰基)吡啶-2-羧酸(2.2g, 10.2mmol, 1.3当量)和1-乙基-3-(3-二甲基氨基丙基)碳化二亚胺(1.5g, 7.84mmol, 1当量)溶于25mL吡啶中并在室温下搅拌12h。浓缩反应混合物并溶于25mL甲苯中。加入4-甲苯磺酸(2.0g, 11.7mmol, 1.5当量)后,将混合物加热回流8h。冷却至RT后,将反应混合物用乙酸乙酯稀释,依次用氯化铵溶液和氯化钠溶液洗涤。粗产物通过柱色谱法(流动相:环己烷、乙酸乙酯)纯化。

[1365] $\log P$ (中性):2.7; MH^+ :371; 1H -NMR(400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm:8.90(s, 1H), 8.71(s, 1H), 8.47-8.45(m, 1H), 8.29-8.27(m, 1H), 3.93(m, 6H)。

[1366] 实施例I-35

[1367] 6-[6-(4-氯吡啶-1-基)-3-乙基磺酰基-2-吡啶基]-7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡嗪

[1368]

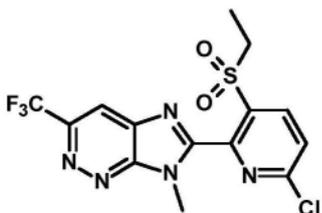


[1369] 将47mg (0.11mmol) 6-(6-氯-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶溶于5mL乙腈中,加入56.6mg碳酸铯(0.17mmol)、10mg (0.05mmol)碘化钾和13.1mg (0.12mmol) 4-氯-1H-吡唑,然后将混合物在室温下搅拌24h。然后将反应混合物经硅胶柱用乙酸乙酯过滤。减压蒸馏除去溶剂,残余物通过柱色谱法使用水/乙腈梯度作为流动相进行纯化。

[1370] (logP(中性): 3.38; MH^+ : 472; 1H -NMR(400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1.25(t, 3H), 3.81(q, 2H), 4.09(s, 3H), 8.18(s, 1H), 8.39(d, 1H), 8.72(d, 1H), 8.83(s, 1H), 9.01(s, 1H)。

[1371] 6-(6-氯-3-乙基磺酰基-2-吡啶基)-7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶(实施例XIII-5)

[1372]

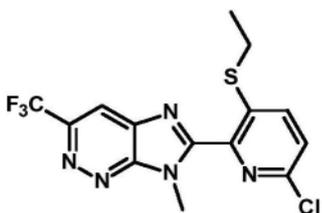


[1373] 将54mg (0.14mmol) 6-(6-氯-3-乙基硫基-2-吡啶基)-7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶溶于5mL二氯甲烷中,在室温下加入80mg (1.73mmol) 甲酸和140mg (1.44mmol) 35%浓度的过氧化氢,然后将混合物在室温下搅拌6h。用水稀释反应混合物并与亚硫酸氢钠溶液混合,搅拌1h,然后与饱和碳酸氢钠溶液混合。分离有机相,水相用二氯甲烷萃取两次,然后将合并的有机相在减压下除去溶剂。

[1374] (logP(中性): 2.60; MH^+ : 406; 1H -NMR(400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1.21(t, 3H), 3.73(q, 2H), 4.00(s, 3H), 8.18(d, 1H), 8.60(d, 1H), 8.80(s, 1H)。

[1375] 6-(6-氯-3-乙基硫基-2-吡啶基)-7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶(实施例XI-6)

[1376]

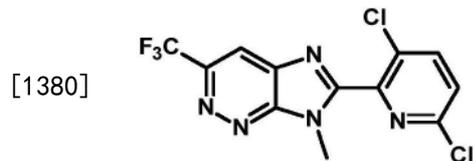


[1377] 将88mg (0.19mmol) 6-(3,6-二氯-2-吡啶基)-7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]吡啶溶于3mL四氢呋喃中,在-20℃下与8mg (0.19mmol) 氢化钠混合并在-20℃下搅拌15分钟。然后,在-20℃下滴加13mg (0.20mmol) 乙硫醇,将冷却浴除去并然后将混合物在0℃下搅拌1h并在室温下搅拌1h。将反应混合物倒入冰水中并然后搅拌过夜。水相用乙酸乙酯萃取

三次。合并有机相,用硫酸钠干燥,然后减压蒸馏除去溶剂。

[1378] ($\log P$ (中性):3.28; MH^+ :374; 1H -NMR(400MHz, D_6 -DMSO) δ_{ppm} :1.23(t,3H),3.07(q,2H),4.15(s,3H),7.79(d,1H),8.17(d,1H),8.76(s,1H)。

[1379] 6-(3,6-二氯-2-吡啶基)-7-甲基-3-(三氟甲基)咪唑并[4,5-c]哒嗪(实施例IX-7)

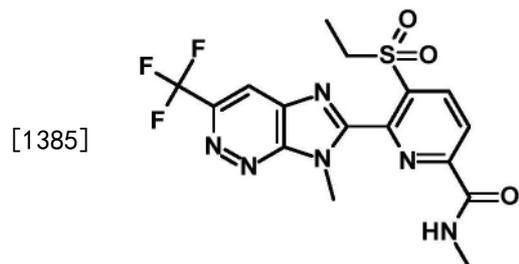


[1381] 首先将255mg(1.33mmol)3,6-二氯吡啶-2-甲酰胺、341.8mg(1.33mmol)4-溴-N-甲基-6-(三氟甲基)哒嗪-3-胺、175mg叔丁醇钾和87mg[1,1'-双(二苯基膦)二茂铁]钯(II)氯化物加入到10mL甲苯中,并在回流下搅拌11h。然后,将反应混合物用水稀释并用乙酸乙酯萃取两次。将合并的有机相用硫酸钠干燥,然后减压蒸馏除去溶剂。残余物通过柱色谱法使用水/乙腈梯度作为流动相进行纯化。

[1382] ($\log P$ (中性):2.65; MH^+ :348; 1H -NMR(400MHz, D_6 -DMSO) δ_{ppm} :4.10(s,3H),7.93(d,1H),8.39(d,1H),8.79(s,1H)。

[1383] 实施例I-39

[1384] 5-(乙基磺酰基)-N-甲基-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)-7H-咪唑并[4,5-c]哒嗪-6-基]吡啶-2-甲酰胺

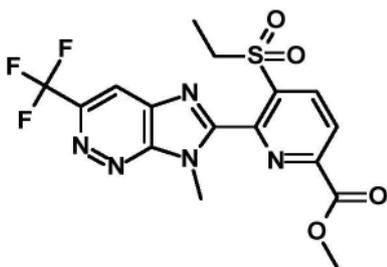


[1386] 将5-(乙基磺酰基)-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)-7H-咪唑并[4,5-c]哒嗪-6-基]吡啶-2-甲酸甲酯(55mg,0.12mmol)溶于甲醇中,加入甲胺(33%的乙醇溶液,120mg,1.28mmol)和0.1mL水。在室温下搅拌20min后,浓缩反应溶液并通过HPLC(乙腈、水、甲酸)纯化。

[1387] $\log P$ (中性):1.96; MH^+ :429; 1H -NMR(400MHz, D_6 -DMSO) δ_{ppm} :9.02-8.99(m,1H),8.83(s,1H),8.77-8.75(m,1H),8.54-8.52(m,1H),4.02(s,1H),3.82-3.77(m,2H),2.85-2.84(m,3H),1.24-1.20(m,3H)。

[1388] 5-(乙基磺酰基)-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)-7H-咪唑并[4,5-c]哒嗪-6-基]吡啶-2-甲酸甲酯(LXXX-2)

[1389]



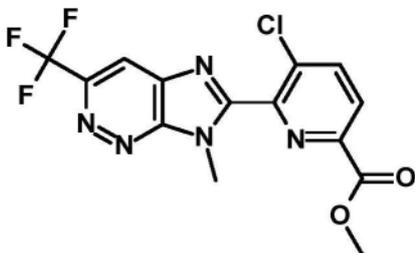
[1390] 在氩气氛下,将5-氯-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)-7H-咪唑并[4,5-c]哒嗪-6-基]吡啶-2-甲酸甲酯(120mg,0.27mmol,1当量)溶于3mL无水DMF中。加入乙硫醇钠(70mg,0.83mmol,3当量)并将混合物在室温下搅拌2h。将混合物倒入1N HCl中并用乙酸乙酯稀释。然后用饱和氯化钠溶液洗涤。有机相用硫酸钠干燥并在旋转蒸发器上除去溶剂。粗产物不经进一步纯化而用于随后的反应中。

[1391] 将5-(乙基磺基)-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)-7H-咪唑并[4,5-c]哒嗪-6-基]吡啶-2-甲酸甲酯(105mg,0.26mmol,1当量)溶于8mL二氯甲烷中。在室温下,加入甲酸(121mg,2.64mmol,10当量)和过氧化氢溶液(35%,359mg,3.69mmol,14当量),并将混合物搅拌12h。加入2mL水后,缓慢滴加2mL 40%亚硫酸氢钠溶液,搅拌混合物1h。然后分离出有机相,用饱和碳酸氢钠溶液洗涤,用硫酸钠干燥并浓缩。残余物通过色谱法(流动相:环己烷、乙酸乙酯)纯化。

[1392] $\log P$ (中性): 2.19; MH^+ : 430; ^1H-NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 8.80-8.78 (m, 2H), 8.59-8.57 (m, 1H), 3.97-3.96 (m, 6H), 3.81-3.75 (m, 2H), 1.23-1.19 (m, 3H)。

[1393] 5-氯-6-[7-甲基-3-(三氟甲基)-7H-咪唑并[4,5-c]哒嗪-6-基]吡啶-2-甲酸甲酯(LXXVIII-2)

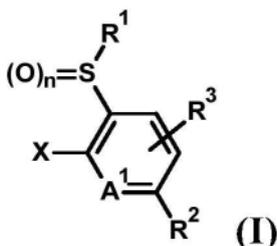
[1394]



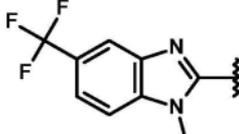
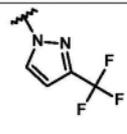
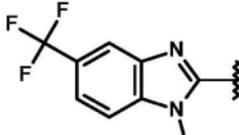
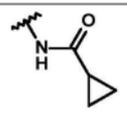
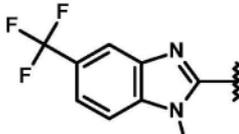
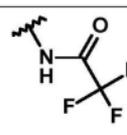
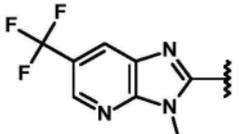
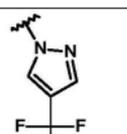
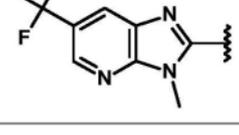
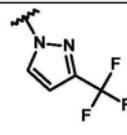
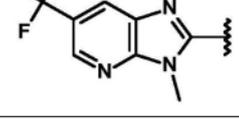
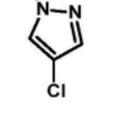
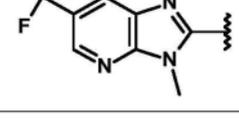
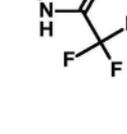
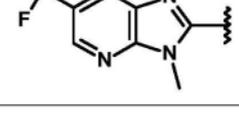
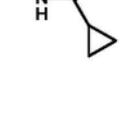
[1395] 将3-氯-6-(甲氧基羰基)吡啶-2-羧酸(168mg,0.78mmol)溶于4mL DCM和0.001mL DMF中。在室温下,滴加草酰氯(0.168mL,1.9mmol)并将反应混合物搅拌1h。在旋转蒸发器上除去所有挥发性组分,将粗产物溶于10mL 1,4-二噁烷中。加入N3-甲基-6-(三氟甲基)咪唑-3,4-二胺(150mg,0.78mmol),将溶液在90°C下边加热边搅拌12h。在旋转蒸发器上除去二噁烷后,残余物通过色谱法(流动相:环己烷、乙酸乙酯)纯化。

[1396] 类似于所述实施例并根据上述制备方法,可以获得以下式(I)的化合物:

[1397]



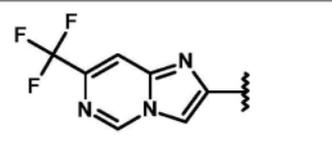
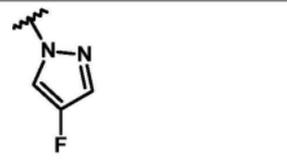
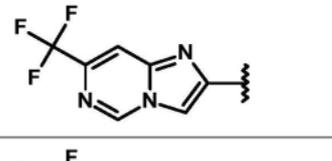
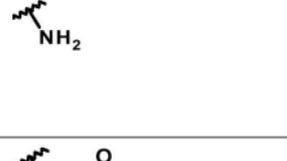
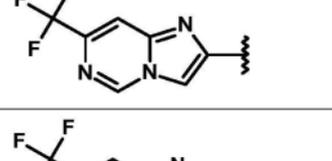
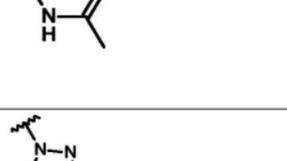
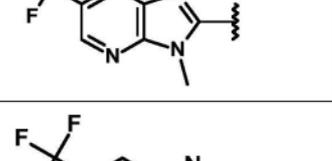
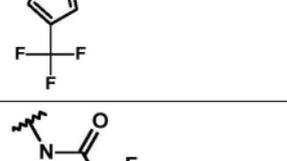
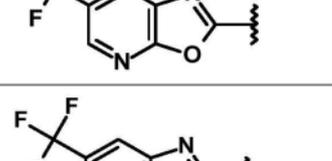
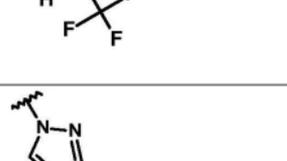
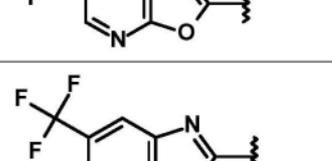
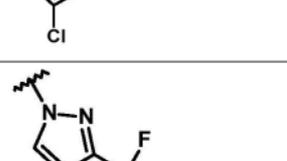
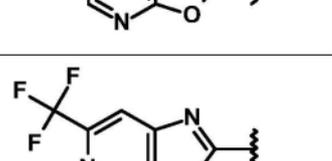
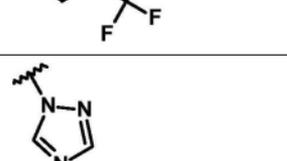
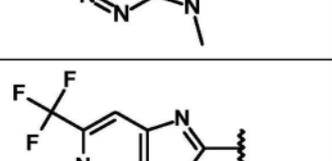
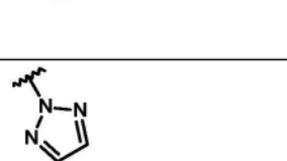
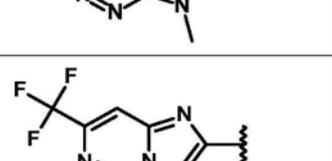
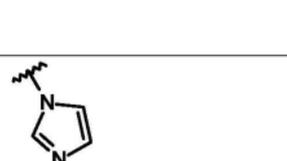
[1398] 其中取代基 R^1 、 R^2 、 R^3 、 A^1 、 X 和 n 具有下表中给出的含义且其中 R^2 和 X 连接分子剩余部分的键由波浪线表征：

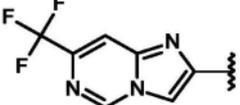
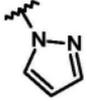
实施例	R^1	n	A^1	R^3	X	R^2
实施例 I-9	$-\text{CH}_2\text{CH}_3$	2	N	H		
实施例 I-10	$-\text{CH}_2\text{CH}_3$	2	N	H		
实施例 I-11	$-\text{CH}_2\text{CH}_3$	2	N	H		
实施例 I-12	$-\text{CH}_2\text{CH}_3$	1	N	H		
实施例 I-13	$-\text{CH}_2\text{CH}_3$	2	N	H		
实施例 I-14	$-\text{CH}_2\text{CH}_3$	2	N	H		
实施例 I-15	$-\text{CH}_2\text{CH}_3$	2	N	H		
实施例 I-16	$-\text{CH}_2\text{CH}_3$	2	N	H		

[1399]

实施例 I-20	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-21	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-22	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-23	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-24	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-25	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-26	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-27	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-28	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-29	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

[1400]

实施例 I-30	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-31	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-32	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-33	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-40	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
[1401] 实施例 I-41	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-42	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-43	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-44	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
实施例 I-45	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

实施例 I-46	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
----------	----------------------------------	---	---	---	--	---

[1402]

实施例	Log P (中性)	¹ H NMR
I-9	4.21	¹ H-NMR(400.0 MHz, DMSO): δ= 8.977(1.6); 8.975(1.8); 8.970(1.9); 8.968(1.7); 8.729(3.0); 8.707(3.5); 8.419(3.5); 8.397(3.2); 8.315(0.5); 8.161(2.6); 8.000(1.7); 7.979(2.5); 7.970(1.7); 7.766(1.4); 7.763(1.4); 7.745(1.2); 7.741(1.2); 7.176(2.6); 7.169(2.6); 6.709(1.9); 6.703(1.9); 5.755(1.6); 3.951(0.9); 3.933(3.2); 3.914(3.4); 3.895(16.0); 3.327(23.5); 2.526(0.5); 2.513(11.7); 2.508(24.8); 2.504(33.6); 2.499(24.2); 2.495(11.5); 1.990(0.8); 1.398(1.0); 1.263(3.3); 1.245(7.4); 1.226(3.2); 1.176(0.5)
I-10	2.92	¹ H-NMR(400.0 MHz, DMSO): δ= 11.564(2.7); 11.314(0.3); 8.706(0.4); 8.679(0.5); 8.658(0.5); 8.497(2.0); 8.486(0.7); 8.474(5.1); 8.468(0.7); 8.446(4.4); 8.424(1.8); 8.119(3.1); 8.101(0.4); 8.070(0.6); 8.049(0.6); 7.952(1.9); 7.942(0.5); 7.931(2.3); 7.920(0.6); 7.741(0.4); 7.728(1.7); 7.725(1.9); 7.707(1.4); 7.703(1.4); 5.753(5.9); 4.278(0.9); 4.260(1.7); 4.243(0.9); 3.908(0.4); 3.902(0.6); 3.889(0.4); 3.884(0.6); 3.782(3.8); 3.774(16.0); 3.711(1.1); 3.699(1.5); 3.693(3.4); 3.682(1.4); 3.675(3.5); 3.653(1.4); 3.636(0.5); 3.322(32.3); 2.920(0.4); 2.633(0.5); 2.564(0.5); 2.524(0.6); 2.511(16.7); 2.506(34.9); 2.502(47.0); 2.497(33.9); 2.493(16.3); 2.444(0.7); 2.424(1.4); 2.403(0.9); 2.382(0.4); 2.364(0.7); 2.346(0.4); 2.162(0.6); 2.142(0.7); 2.123(0.5); 2.087(0.4); 2.074(0.6); 2.056(1.2); 2.048(0.7); 2.041(1.3); 2.026(1.0); 2.011(0.6); 1.951(0.4); 1.934(0.5); 1.916(0.4); 1.628(0.4); 1.256(0.7); 1.243(0.9); 1.237(1.5); 1.224(0.5); 1.219(0.6); 1.189(3.6); 1.171(8.1); 1.152(3.5); 1.050(0.5); 1.042(0.8); 1.031(0.8); 0.997(0.4); 0.990(0.7); 0.982(0.4); 0.978(0.5); 0.971(0.8); 0.963(0.4); 0.928(0.3); 0.909(7.7); 0.896(3.8); 0.892(3.6); 0.862(0.4); 0.845(0.4); 0.826(0.4); 0.818(0.4); 0.811(0.5); 0.806(0.5); 0.146(0.4); 0.008(2.7); 0.000(76.8); -0.009(2.8); -0.150(0.4)
I-11	3.27	¹ H-NMR(400.0 MHz, DMSO): δ= 12.721(1.4); 8.623(2.8); 8.601(3.5); 8.432(3.5); 8.410(2.9); 8.134(2.3); 7.965(1.5); 7.944(1.9); 7.742(1.3); 7.738(1.3); 7.720(1.1); 7.716(1.1); 3.804(15.0); 3.779(3.0); 3.761(3.1); 3.742(0.9); 3.320(28.3); 2.670(0.3); 2.524(0.7); 2.519(1.1); 2.510(20.2); 2.506(43.3); 2.501(58.5); 2.497(41.8); 2.492(19.7); 2.328(0.3); 1.988(0.9); 1.398(16.0); 1.213(3.2); 1.194(7.3); 1.176(3.4); 0.146(0.3); 0.008(2.6); 0.000(82.6); -0.009(2.7); -0.150(0.4)
I-12	4.23	¹ H-NMR(400.0 MHz, DMSO): δ= 20.013, 9.359, 8.940, 8.936, 8.758, 8.754, 8.745, 8.724, 8.445, 8.439, 8.417, 5.754, 4.341, 4.227, 3.592, 3.574, 3.560, 3.541, 3.318, 3.119, 3.100, 3.086, 3.067, 2.525, 2.520, 2.511, 2.507, 2.502, 2.498, 2.493, 1.344, 1.325, 1.307, 0.000
I-13	4.09	¹ H-NMR(400.0 MHz, DMSO): δ= 9.006(1.4); 9.004(1.5); 8.999(1.6); 8.997(1.4); 8.938(1.9); 8.934(2.0); 8.752(2.6); 8.730(3.8); 8.723(2.0); 8.448(3.1); 8.426(2.7); 7.971(0.7); 7.184(2.2); 7.177(2.2); 6.708(0.8); 6.703(0.7); 5.755(1.4); 3.930(0.8); 3.911(16.0); 3.893(2.8); 3.875(0.8); 3.322(18.0); 2.526(0.4); 2.513(9.9); 2.508(20.9); 2.504(28.1); 2.499(20.1); 2.495(9.4); 1.273(2.9); 1.255(6.5); 1.236(2.9)
I-14	3.9	¹ H-NMR(400.0 MHz, DMSO): δ= 9.009(4.8); 8.934(2.1); 8.930(2.1); 8.717(2.2); 8.713(2.2); 8.702(3.2); 8.680(3.7); 8.365(3.7); 8.343(3.4); 8.156(4.8); 7.959(0.5); 7.548(0.4); 5.754(3.7); 3.908(16.0); 3.889(3.1); 3.870(3.0); 3.852(0.9); 3.325(48.7);

		2.526(0.4); 2.513(11.6); 2.508(24.7); 2.504(33.3); 2.499(23.7); 2.495(11.1); 1.268(3.3); 1.250(7.5); 1.231(3.3); 0.000(0.3)
I-15	2.00	¹ H-NMR(400.0 MHz, DMSO): δ = 12.747(1.4); 8.908(2.2); 8.905(2.2); 8.702(2.3); 8.698(2.3); 8.641(1.4); 8.618(1.7); 8.453(2.2); 8.431(1.8); 8.313(0.6); 3.821(16.0); 3.812(0.9); 3.775(0.9); 3.757(3.1); 3.738(3.2); 3.720(1.0); 3.317(166.8); 2.679(0.6); 2.675(1.3); 2.670(1.9); 2.666(1.4); 2.661(0.6); 2.524(3.9); 2.519(5.8); 2.510(107.8); 2.506(234.7); 2.501(320.4); 2.497(228.0); 2.492(106.0); 2.337(0.6); 2.333(1.3); 2.328(1.9); 2.323(1.3); 2.319(0.6); 1.398(11.3); 1.353(0.4); 1.221(3.5); 1.203(8.0); 1.184(3.4); 0.146(1.9); 0.008(13.8); 0.000(464.6); -0.009(14.8); -0.150(1.9)
I-16	2.76	¹ H-NMR(400.0 MHz, DMSO): δ = 11.596(2.6); 8.896(2.3); 8.893(2.4); 8.685(2.4); 8.680(2.3); 8.525(2.0); 8.503(5.1); 8.474(4.3); 8.452(1.8); 5.754(3.0); 3.790(16.0); 3.690(0.9); 3.671(3.2); 3.653(3.3); 3.634(1.0); 3.353(9.4); 3.343(16.3); 3.338(18.2); 3.334(18.0); 3.323(16.5); 2.525(0.6); 2.512(15.5); 2.507(32.9); 2.503(44.6); 2.498(31.9); 2.494(15.1); 2.060(0.8); 2.044(1.0); 2.029(0.9); 1.198(3.4); 1.180(7.8); 1.161(3.3); 0.914(7.3); 0.899(4.8); 0.008(2.0); 0.000(64.8); -0.009(2.0)
I-20	2.79	¹ H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 12.491(0.4); 11.394(2.6); 8.896(2.3); 8.893(2.3); 8.686(2.3); 8.683(2.3); 8.540(0.3); 8.517(6.7); 8.516(6.3); 8.493(0.4); 5.754(1.5); 3.788(13.0); 3.702(0.8); 3.683(2.8); 3.665(2.8); 3.646(0.9); 3.401(7.5); 3.323(3.9); 3.199(3.5); 2.508(18.2); 2.503(24.4); 2.499(18.6); 2.179(16.0); 2.118(5.4); 1.205(2.9); 1.187(6.4); 1.168(2.9); 0.000(1.7)
I-21	2.31	¹ H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 11.471(2.9); 8.897(2.5); 8.894(2.5); 8.691(2.6); 8.687(2.5); 8.543(0.6); 8.521(6.6); 8.516(6.1); 8.494(0.6); 5.753(2.3); 4.038(0.8); 4.020(0.8); 3.792(16.0); 3.693(0.8); 3.675(2.7); 3.656(2.8); 3.638(1.1); 3.609(0.9); 3.595(0.9); 3.572(0.6); 3.317(45.5); 3.302(2.7); 3.288(0.8); 3.272(1.3); 3.262(0.8); 3.009(14.6); 2.675(0.4); 2.670(0.5); 2.666(0.4); 2.524(1.4); 2.510(30.2); 2.506(62.1); 2.501(85.8); 2.497(64.9); 2.493(32.1); 2.333(0.4); 2.328(0.5); 2.324(0.4); 2.115(0.7); 1.988(3.3); 1.287(5.0); 1.270(5.0); 1.235(2.9); 1.201(3.5); 1.193(1.4); 1.183(7.9); 1.175(2.4); 1.164(3.4); 1.158(1.2); 0.881(0.4); 0.854(0.3); 0.008(2.8); 0.000(72.9); -0.008(3.0)
I-22	2.49	¹ H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 9.588(6.3); 8.938(2.3); 8.935(2.4); 8.779(3.6); 8.757(4.1); 8.727(2.4); 8.723(2.3); 8.460(7.3); 8.352(4.0); 8.330(3.7); 5.753(0.3); 3.934(1.1); 3.923(16.0); 3.916(3.7); 3.897(3.0); 3.879(0.9); 3.353(23.6); 3.340(16.9); 3.335(18.2); 3.332(16.8); 2.527(0.4); 2.514(9.4); 2.510(20.0); 2.505(27.3); 2.500(19.7); 2.496(9.4); 1.277(3.6); 1.259(8.2); 1.240(3.5); 0.000(8.4)
I-23	2.66	¹ H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 9.064(3.9); 9.061(3.8); 8.940(2.5); 8.935(3.5); 8.929(2.3); 8.820(3.0); 8.798(3.9); 8.770(2.7); 8.748(3.3); 8.734(2.7); 8.730(4.2); 8.646(3.9); 8.625(3.2); 8.534(3.3); 8.512(2.8); 8.360(11.8); 8.091(4.0); 8.087(4.0); 3.942(1.0); 3.924(3.5); 3.912(16.0); 3.906(4.3); 3.887(1.7); 3.878(14.3); 3.855(2.9); 3.836(0.9); 3.321(55.0); 2.677(0.4); 2.672(0.5); 2.668(0.4); 2.525(1.2); 2.512(28.8); 2.507(58.5); 2.503(79.8); 2.498(60.0); 2.494(29.6); 2.334(0.3); 2.330(0.5); 2.325(0.4); 2.075(6.8); 1.285(3.4); 1.266(9.4); 1.249(8.6); 1.231(2.9); 0.000(1.1)
I-24	3.55	¹ H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 8.931(2.4); 8.927(2.6); 8.897(2.2); 8.885(2.3); 8.715(2.5); 8.712(2.5); 8.682(3.2); 8.660(3.7); 8.368(3.6); 8.346(3.3); 8.161(2.2); 8.150(2.3); 5.754(1.6); 3.899(16.0); 3.878(3.3); 3.859(3.2); 3.841(1.0); 3.318(27.4); 2.525(0.4); 2.512(11.4); 2.508(24.9); 2.503(35.7); 2.499(27.2); 1.264(3.5); 1.246(7.7); 1.227(3.4)
I-25	3.26	¹ H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 12.256(1.4); 11.381(1.4); 8.896(1.3); 8.892(1.3); 8.688(1.3); 8.684(1.3); 8.582(1.2); 8.5

[1403]

[1404]

		59(2.3);8.508(2.0);8.486(1.1);5.754(4.5);3.786(8.1);3.681(0.4);3.662(1.4);3.643(1.4);3.625(0.5);3.321(1.3);3.007(0.4);2.986(0.4);2.814(0.6);2.793(0.5);2.781(0.7);2.760(0.6);2.731(0.8);2.714(1.1);2.700(1.1);2.683(1.5);2.603(0.6);2.586(1.2);2.569(1.3);2.559(0.7);2.552(0.9);2.544(0.7);2.536(0.3);2.526(2.5);2.508(10.6);2.503(14.0);2.499(10.6);2.494(6.4);2.478(0.9);2.074(10.3);2.052(16.0);1.199(2.2);1.194(3.6);1.181(4.8);1.177(4.0);1.163(1.8);1.138(6.6);1.121(6.6);0.000(2.0)
I-26	2.27	¹ H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 8.861(2.5);8.857(2.5);8.702(1.4);8.688(1.4);8.613(2.5);8.609(2.5);8.003(1.9);7.981(2.0);6.874(0.6);6.852(0.6);4.950(0.3);4.934(0.7);4.918(0.8);4.902(0.5);4.805(1.6);4.788(2.7);4.771(1.3);4.507(1.6);4.492(2.9);4.477(1.4);4.038(0.9);4.020(0.9);3.740(1.6.0);3.626(0.7);3.607(2.1);3.589(2.2);3.570(0.7);3.318(26.9);2.675(0.6);2.671(0.8);2.666(0.6);2.524(1.9);2.511(46.0);2.506(97.7);2.502(137.2);2.497(103.1);2.493(50.3);2.333(0.6);2.329(0.8);2.324(0.6);1.989(4.0);1.193(1.1);1.182(3.3);1.175(2.6);1.163(7.4);1.158(2.0);1.145(3.2);0.008(0.9);0.000(27.8);-0.008(1.1)
I-27	2.28	¹ H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 9.708(3.4);9.670(2.2);9.072(2.7);9.069(2.9);8.968(3.3);8.774(5.3);8.759(2.3);8.737(2.6);8.708(3.6);8.686(4.1);8.428(2.7);8.413(2.3);8.407(2.9);8.396(3.4);8.336(4.6);8.331(16.0);8.314(4.4);8.117(2.8);8.114(3.0);4.206(0.7);4.188(2.3);4.169(2.4);4.158(1.2);4.151(0.9);4.139(3.6);4.121(3.6);4.102(1.1);4.038(0.6);4.020(0.6);3.721(0.4);3.317(119.0);2.675(1.5);2.671(2.1);2.666(1.6);2.524(6.6);2.510(122.7);2.506(251.4);2.502(347.0);2.497(264.1);2.493(132.1);2.333(1.5);2.328(2.0);2.324(1.5);1.989(2.6);1.309(2.5);1.295(4.4);1.290(6.3);1.276(8.9);1.258(3.8);1.193(0.7);1.175(1.3);1.157(0.6);0.146(0.4);0.008(2.9);0.000(77.5);-0.008(2.9);-0.149(0.3)
I-28	2.19	¹ H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 14.012(0.4);9.664(6.2);9.617(12.5);9.002(9.5);8.719(6.8);8.697(7.5);8.560(0.6);8.557(0.6);8.442(13.1);8.408(6.1);8.314(1.8);8.145(7.4);8.124(6.9);7.978(0.6);4.208(2.0);4.189(6.5);4.171(6.5);4.152(1.9);4.038(0.9);4.021(0.8);4.002(0.4);3.425(0.3);3.318(584.0);2.675(3.6);2.670(4.9);2.666(3.6);2.631(0.5);2.524(15.2);2.510(290.5);2.506(594.5);2.501(820.4);2.497(623.2);2.492(310.6);2.333(3.3);2.328(4.7);2.324(3.5);1.988(3.7);1.300(7.1);1.282(16.0);1.263(7.1);1.245(0.4);1.234(0.4);1.193(1.0);1.175(2.0);1.157(1.0);0.146(0.8);0.008(6.7);0.000(190.3);-0.008(7.3);-0.150(0.9)
I-29	3.74	¹ H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 9.660(6.3);9.048(3.8);9.043(3.9);8.994(9.6);8.699(6.7);8.677(7.6);8.406(6.2);8.241(7.3);8.219(6.8);7.221(5.2);7.214(5.1);4.200(1.9);4.181(6.4);4.163(6.5);4.144(1.9);4.039(0.5);4.021(0.5);3.321(57.0);2.677(0.5);2.672(0.7);2.668(0.5);2.525(2.0);2.512(39.9);2.508(81.4);2.503(111.7);2.498(84.4);2.494(42.0);2.334(0.5);2.330(0.7);2.325(0.5);1.989(2.0);1.398(1.2);1.299(7.1);1.280(16.0);1.262(7.0);1.194(0.5);1.176(1.0);1.158(0.5);0.008(0.9);0.000(25.6);-0.008(1.0)
I-30	酸性 : 3.13	¹ H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 9.645(7.3);8.987(10.2);8.934(4.9);8.923(5.2);8.630(6.1);8.608(7.0);8.394(7.1);8.313(0.8);8.163(6.8);8.141(6.6);8.129(5.2);8.119(5.4);5.753(0.6);4.179(2.1);4.161(6.9);4.142(7.3);4.124(2.5);3.320(305.1);3.301(18.1);2.671(2.2);2.541(2.6);2.506(258.0);2.502(360.8);2.498(301.0);2.329(2.1);1.989(0.8);1.398(0.4);1.290(7.2);1.272(16.0);1.253(7.8);1.176(0.5);0.000(18.3);-0.019(0.7)
I-31	1.59	¹ H-NMR(400.0 MHz, d6-DMSO): δ = 9.726(1.1);9.655(7.7);8.428(10.8);8.354(1.2);8.340(1.9);8.293(7.5);8.024(0.9);8.002(1.0);7.931(6.0);7.909(6.3);7.280(1.2);7.109(7.0);6.667(1.0);6.644(1.0);6.617(6.4);6.595(6.3);4.094(0.5);4.081(0.5);3.809(2.1);3.791(7.1);3.772(7.2);3.754(2.2);3.319(23.6);3.176(2.1);3.163(2.0);3.030(0.3);3.012(1.1);2.994(1.1);2.975(0.4);2.671(0.6);2.506(74.4);2.502(99.7);2.498(77.7);2.329(0.6);1.195(7.4);1.177(16.0);1.158(7.3);1.017(1.2);0.999(2.5);0.981(1.1);0.007(2.4);0.000(49.9);-0.008(2.4)

[1405]

I-32	1.99	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 11.154(2.4);9.723(3.2);8.544(4.9);8.448(0.4);8.424(2.2);8.402(3.8);8.351(3.4);8.341(3.3);8.319(2.0);4.038(0.5);4.021(0.5);3.903(0.9);3.884(3.2);3.866(3.2);3.847(1.0);3.320(62.4);2.676(0.4);2.671(0.5);2.667(0.4);2.524(1.5);2.511(28.9);2.507(58.7);2.502(80.5);2.498(60.4);2.493(29.6);2.333(0.4);2.329(0.5);2.324(0.4);2.173(16.0);1.989(2.0);1.214(3.6);1.195(8.1);1.177(3.9);1.158(0.5);1.018(0.4);0.008(0.8);0.000(20.3);-0.008(0.7)
I-33	4.04	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.421(2.9);8.940(2.2);8.936(2.3);8.756(3.0);8.734(3.6);8.725(2.4);8.721(2.3);8.473(4.1);8.451(3.5);8.429(3.1);3.913(16.0);3.895(3.2);3.876(3.2);3.858(0.9);3.320(76.4);2.676(0.3);2.671(0.5);2.667(0.3);2.525(1.3);2.511(28.6);2.507(59.0);2.502(78.7);2.498(56.9);2.493(27.6);2.334(0.4);2.329(0.5);2.325(0.3);1.398(3.5);1.271(3.2);1.252(7.4);1.234(3.3);0.008(0.4);0.000(11.5);-0.008(0.5)
I-40	3.09	¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): d= 12.997(1.2);11.045(0.5);10.220(0.7);9.060(5.3);9.031(5.1);8.964(0.7);8.757(0.3);8.703(4.3);8.681(5.7);8.650(0.4);8.534(5.8);8.512(4.7);8.371(0.5);8.349(0.3);7.958(0.4);7.714(0.4);7.682(0.4);7.558(0.4);4.239(0.5);4.222(1.0);4.206(0.5);3.845(2.1);3.827(6.5);3.808(6.5);3.790(2.2);3.708(0.4);3.632(0.6);3.608(0.7);3.600(0.8);3.582(1.0);3.564(1.2);3.521(1.9);3.502(2.3);3.384(47.5);3.346(54.0);3.170(0.6);3.123(0.5);3.085(0.4);2.677(1.9);2.673(2.4);2.508(255.9);2.504(327.2);2.500(240.9);2.331(2.1);2.327(1.7);2.088(0.6);1.911(6.5);1.660(0.4);1.644(0.5);1.623(0.4);1.474(0.4);1.430(0.3);1.398(0.7);1.384(0.7);1.364(0.7);1.337(1.2);1.290(7.7);1.272(16.0);1.253(8.0);1.235(4.1);1.212(1.7);1.205(1.3);1.187(1.8);1.168(1.1);1.148(2.8);1.107(0.6);1.089(0.5);1.066(0.5);1.005(0.5);0.986(0.8);0.968(0.5);0.931(1.1);0.913(1.8);0.894(1.0);0.855(1.4);0.834(1.4);0.813(1.1);0.746(0.4);0.723(0.4);0.147(0.5);0.001(95.8);-0.149(0.4)
I-41	4.01	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.07 – 9.05 (m, 2H), 8.93 (s, 1H), 8.75 – 8.72 (m, 1H), 8.43 – 8.41 (m, 1H), 8.19 (s, 1H), 3.84 – 3.83 (m, 2H), 1.30 – 1.27 (m, 3H)
I-42	4.17	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): 9.07 – 9.05 (m, 2H), 8.94 – 8.93 (m, 1H), 8.80 – 8.77 (m, 1H), 8.51 – 8.49 (m, 1H), 7.20-7-19 (m, 1H), 3.88 – 3.86 (m, 2H), 1.32 – 1.17 (m, 3H)
I-43	2.08	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): d= 9.582(6.4);8.832(6.1);8.807(3.2);8.786(3.6);8.476(6.4);8.399(3.6);8.377(3.3);4.100(16.0);3.863(1.0);3.845(3.4);3.826(3.4);3.808(1.1);3.322(94.8);2.675(0.6);2.671(0.8);2.506(103.3);2.502(134.9);2.498(98.2);2.328(0.7);2.324(0.6);1.273(3.7);1.255(8.2);1.236(4.3);0.146(0.6);0.008(5.5);0.000(123.0);-0.150(0.6)
I-44	2.21	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): d= 8.836(0.4);8.823(5.9);8.801(3.0);8.779(3.7);8.585(3.6);8.563(3.1);8.372(13.0);4.088(0.7);4.047(16.0);3.812(1.0);3.794(3.3);3.775(3.4);3.757(1.0);3.322(45.9);2.675(0.3);2.671(0.4);2.667(0.3);2.506(58.1);2.502(76.0);2.498(55.7);2.329(0.4);1.262(4.0);1.243(8.5);1.225(3.8);0.007(2.8);-0.001(59.3);-0.009(2.9)
I-45	2.07	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): d= 20.010(0.6);9.645(7.8);8.943(10.5);8.766(7.9);8.611(5.8);8.589(6.5);8.395(7.8);8.316(0.8);8.189(0.6);8.140(8.2);8.137(8.5);8.113(5.6);7.220(7.5);4.635(0.6);4.180(2.3);4.162(7.0);4.143(7.1);4.126(2.3);3.321(394.3);2.906(0.6);2.670(4.6);2.501(814.9);2.328(4.6);1.296(7.5);1.277(16.0);1.259(7.4);0.146(1.9);0.041(0.6);0.038(0.7);-0.001(436.0);-0.149(2.2);-3.611(0.6)
I-46	2.58	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): d= 16.349(0.3);12.568(0.4);9.656(8.1);9.203(1.0);8.957(0.4);8.931(10.4);8.805(6.3);8.798(6.3);8.715(1.4);8.626(5.8);8.605(6.4);8.552(1.4);8.530(1.6);8.493(0.7);8.395(8.

[1406]	<p>0);8.358(0.3);8.313(0.5);8.268(1.4);8.248(1.3);8.181(6.6);8.160(6.0);7.985(8.3);6.711(6.3);6.684(1.5);5.507(0.3);4.153(2.4);4.135(7.3);4.116(7.3);4.098(2.6);3.719(0.4);3.643(0.4);3.600(0.5);3.589(0.8);3.571(1.9);3.553(2.0);3.533(0.9);3.488(0.9);3.330(497.4);3.213(0.8);3.174(0.5);3.105(0.3);2.990(0.3);2.672(2.8);2.502(491.2);2.429(0.7);2.404(0.5);2.380(0.4);2.328(2.7);2.300(0.4);2.074(2.3);1.288(7.6);1.270(16.0);1.251(7.8);1.234(2.4);1.216(4.0);1.198(1.9);1.164(0.5);1.148(0.4);0.145(1.1);0.000(225.6);-0.001(218.4);-0.071(0.5);-0.151(1.4)</p>
--------	---

[1407] logP值根据EEC指令79/831附录V.A8通过HPLC(高效液相色谱)在反相柱(C18)上测量。温度:55℃。

[1408] 酸性范围内的LC-MS测定使用0.1%甲酸水溶液和乙腈(含有0.1%甲酸)作为流动相在pH 2.7下进行;线性梯度从10%乙腈至95%乙腈。在表中称为logP(HCOOH)。

[1409] 中性范围内的LC-MS测定用0.001摩尔碳酸氢铵水溶液和乙腈作为流动相在pH 7.8下进行;线性梯度从10%乙腈至95%乙腈。在表中称为logP(中性)。

[1410] 使用具有已知logP值(基于通过两个连续烷酮之间的线性插值的保留时间确定的logP值)的无支链烷-2-酮(具有3至16个碳原子)进行校准。

[1411] 所选实施例的NMR数据以常规形式(δ 值,多重峰分裂,氢原子数)或作为NMR峰列表的形式列出。

[1412] 在每种情况下,给出了记录NMR谱的溶剂。

[1413] NMR峰值列表方法

[1414] 所选实施例的 ^1H NMR数据以 ^1H NMR峰值列表的形式给出。对于每个信号峰,首先列出以ppm为单位的 δ 值,然后是圆括号内的信号强度。对于不同信号峰值的 δ 值-信号强度数对通过分号彼此间隔列出。

[1415] 因此,一个实施例的峰列表具有以下形式:

[1416] δ_1 (强度 $_1$); δ_2 (强度 $_2$);.....; δ_i (强度 $_i$);.....; δ_n (强度 $_n$)

[1417] 尖锐信号的强度与NMR谱的打印实例(以厘米计)中的信号高度相关,并显示出信号强度的真实比例。对于宽峰信号,可以显示数个峰或信号的中间部分及它们与谱中最强信号相比的相对强度。

[1418] ^1H NMR谱的化学位移的标定使用四甲基硅烷和/或溶剂的化学位移来完成,特别是在DMSO中测量的光谱的情况下。因此,四甲基硅烷峰可以但不一定在NMR峰列表中出现。

[1419] ^1H NMR峰的列表类似于常规 ^1H NMR打印图,因此,其通常含有在常规NMR说明中列出的所有峰。

[1420] 另外,如同常规 ^1H NMR的打印图,它们可显示出溶剂信号、目标化合物的立体异构体(其同样构成了本发明主题的一部分)的信号、和/或杂质的峰。

[1421] 在给出溶剂和/或水的 δ 范围内的化合物信号时,我们的 ^1H NMR峰的列表显示出标准溶剂峰,例如在DMSO- D_6 中的DMSO的峰和水的峰,这通常具有高的平均强度。

[1422] 所述目标化合物的立体异构体的峰和/或杂质的峰通常具有比所述目标化合物(例如具有>90%的纯度)的峰更低的平均强度。

[1423] 此类立体异构体和/或杂质对于特定制备方法来说可以是特有的。因此,通过参考“副产品指纹”,它们的峰可有助于识别我们的制备方法的再现性。

[1424] 如果需要的话,通过已知方法(MestreC,ACD模拟,以及凭经验评估的预期值)计算目标化合物峰的专业人员可以任选地使用额外的强度过滤器分离出目标化合物的峰。这种

分离类似于常规¹H NMR说明中所讨论的峰拾取。

[1425] ¹H NMR峰列表的其他细节可以见于Research Disclosure Database Number 564025。

[1426] 用途实施例

[1427] 辣根猿叶甲虫 (Phaedoncochleariae) - 喷洒测试

[1428] 溶剂:78重量份的丙酮

[1429] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[1430] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[1431] 为了制备合适的活性化合物制剂,使用上述重量份的溶剂来溶解1重量份的活性化合物,用含有浓度为1000ppm乳化剂的水调节至所需浓度。为了制备其他测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。

[1432] 在大白菜(白菜(*Brassica pekinensis*))叶片的叶面上喷洒具有所需浓度的活性化合物制剂,并且干燥后,使芥菜甲虫(辣根猿叶甲虫)的幼虫栖居于叶片。

[1433] 7天后,测定以%计的功效。100%表示所有甲虫幼虫都已被杀死;0%表示没有甲虫幼虫被杀死。

[1434] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为500g/h下显示出100%的功效:I-1、I-2、I-3、I-5、I-6、I-7、I-8、I-10、I-11、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-25、I-29、I-31、I-32

[1435] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100g/ha下显示出83%的功效:I-4

[1436] 草地贪夜蛾 (Spodoptera frugiperda) - 喷洒测试

[1437] 溶剂:78重量份的丙酮

[1438] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[1439] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[1440] 为了制备合适的活性化合物制剂,使用上述重量份的溶剂来溶解1重量份的活性化合物,用含有浓度为1000ppm乳化剂的水调节至所需浓度。为了制备其他测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。

[1441] 在玉米(maize)(玉米(*Zea mays*))叶片上喷洒具有所需浓度的活性化合物制剂,并在干燥后,使夜蛾(草地贪夜蛾)的毛虫栖居于叶片。

[1442] 7天后,测定以%计的功效。100%表示所有毛虫都已被杀死;0%表示没有毛虫被杀死。

[1443] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为500g/ha下显示出100%的功效:I-1、I-2、I-4、I-8、I-9、I-10、I-12、I-13、I-14、I-16、I-17、I-22、I-23、I-24、I-29、I-31

[1444] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为500g/ha下显示出83%的功效:I-7、I-15

[1445] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为500g/ha下显示出80%的功效:I-32

[1446] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100g/ha下显示出100%

的功效:I-5

[1447] 二斑叶螨 (Tetranychusurticae) 喷洒测试、OP-抗性

[1448] 溶剂:78重量份的丙酮

[1449] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[1450] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[1451] 为了制备合适的活性化合物制剂,使用上述重量份的溶剂来溶解1重量份的活性化合物,用含有浓度为1000ppm乳化剂的水调节至所需浓度。为了制备其他测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。

[1452] 在被各阶段的温室红蜘蛛(二斑叶螨)侵染的菜豆(*Phaseolus vulgaris*)叶的叶盘上喷洒具有所需浓度的活性化合物制剂。

[1453] 6天后,测定以%计的功效。100%表示所有叶螨都已被杀死;0%表示没有叶螨被杀死。

[1454] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为500g/ha下显示出90%的功效:I-8

[1455] 桃蚜 (Myzuspersicae) 喷洒测试

[1456] 溶剂:78重量份的丙酮

[1457] 1.5重量份的二甲基甲酰胺

[1458] 乳化剂:烷基芳基聚乙二醇醚

[1459] 为了制备合适的活性化合物制剂,使用上述重量份的溶剂来溶解1重量份的活性化合物,用含有浓度为1000ppm乳化剂的水调节至所需浓度。为了制备其他测试浓度,制剂用含有乳化剂的水进行稀释。

[1460] 在被所有阶段的绿桃蚜(桃蚜)侵染的大白菜(白菜(*Brassica pekinensis*))的叶片的叶盘上喷洒具有所需浓度的活性化合物制剂。

[1461] 5-6天后,测定以%计的功效。100%表示所有蚜虫都已被杀死;0%表示没有蚜虫被杀死。

[1462] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为500g/ha下显示出100%的功效:I-2、I-3、I-15、I-16、I-22

[1463] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为500g/ha下显示出90%的功效:I-5、I-6、I-8、I-11、I-20、I-21、I-23、I-24、I-25、I-31、I-32

[1464] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100g/ha下显示出90%的功效:I-9

[1465] 猫栳头蚤 (Ctenocephalidesfelis) - 与成年猫蚤 (catflea) 的体外接触测试

[1466] 对于试管的涂覆,首先将9mg的活性化合物溶解在1mL分析纯丙酮中,然后用分析纯丙酮稀释到所需浓度。将250 μ L的溶液通过在定轨摇床(以30rpm的摇摆旋转速度持续2h)上旋转和摇摆而均匀分布在25mL试管的内壁和底部上。对于900ppm的活性化合物溶液和44.7cm²内表面,如果均匀分布,则获得基于面积计(area-based)的5 μ g/cm²的剂量。

[1467] 当溶剂蒸发后,在试管中放入5-10个成年猫蚤(猫栳头蚤),用有孔的塑料盖密封,并在室温和环境湿度下水平放置培育。48h后,测定功效。为此,将试管直立并敲击该蚤使之到试管底部。将在底部保持静止或以不协调方式活动的蚤视为死亡或将要死亡。

[1468] 如果在本测试中在 $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$ 的施用率下获得至少80%的功效,则该物质显示出对猫栉头蚤良好的功效。100%的功效表示所有蚤均死亡或将要死亡。0%的功效表示没有蚤受到伤害。

[1469] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为 $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$ (500g/ha) 下显示出100%的功效:I-2、I-10、I-11、I-22

[1470] 血红扇头蜱 (Rhipicephalus sanguineus) -与成年棕色犬蜱的体外接触测试

[1471] 对于试管的涂覆,首先将9mg的活性化合物溶解在1mL分析纯丙酮中,然后用分析纯丙酮稀释到所需浓度。将250 μL 的溶液通过在定轨摇床(以30rpm的摇摆旋转速度持续2h)上旋转和摇摆而均匀分布在25mL试管的内壁和底部上。对于900ppm的活性化合物溶液和44.7 cm^2 内表面,如果均匀分布,则获得基于面积计的 $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$ 的剂量。

[1472] 当溶剂蒸发后,在试管中放入5-10个成年犬蜱(血红扇头蜱),用有孔的塑料盖密封,并在室温和环境湿度下在黑暗中水平放置培育。48h后,测定功效。为此,敲击该蜱使之到试管底部,并在45-50 $^{\circ}\text{C}$ 的电热板上培育不超过5min。将在底部保持静止或以不协调方式活动——即其不能通过向上爬而有意地避开热——的蜱视为死亡或将要死亡。

[1473] 如果在本测试中在 $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$ 的施用率下获得至少80%的功效,则该物质显示出对血红扇头蜱良好的活性。100%的功效表示所有蜱均死亡或将要死亡。0%的功效表示没有蜱受到伤害。

[1474] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为 $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$ (500g/ha) 下显示出80%的功效:I-11

[1475] 微小牛蜱 (Boophilus microplus) -注射测试

[1476] 溶剂:二甲基亚砒

[1477] 为制备合适的活性化合物制剂,将10mg的活性化合物与0.5mL的溶剂混合,并用溶剂将该浓缩物稀释到所需浓度。

[1478] 将1 μL 的该活性化合物溶液注射到5个饱食的成年雌牛蜱(微小牛蜱)的腹腔中。将这些动物转移到培养皿中,放在温控室中。

[1479] 通过7天后能育卵的产卵数来评估功效。将没有明显能育性的卵储存在温控箱中,直到约42天后孵化出幼虫。100%的功效表示没有蜱虫产生任何能育卵;0%的功效表示所有卵都是能育的。

[1480] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为 $20\mu\text{g}/\text{动物}$ 下显示出80%的功效:I-22

[1481] 猫栉头蚤-经口测试(oral test)

[1482] 溶剂:二甲基亚砒

[1483] 为了制备合适的活性化合物制剂,将10mg的活性化合物与0.5mL的二甲基亚砒混合。用柠檬酸化的牛血稀释,得到所需浓度。

[1484] 将约20个未进食的成年猫蚤(猫栉头蚤)放置到顶部和底部用纱布(gauze)密封的容器内。将底部用石蜡膜密封的金属圆筒放置在容器上。圆筒中含有血液/活性化合物制剂,其可以被跳蚤透过石蜡膜而吸取。

[1485] 2天后,测定以%计的杀死率。100%表示所有跳蚤都已被杀死;0%表示没有跳蚤被杀死。

[1486] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100ppm下显示出100%的功效:I-10、I-11、I-22。

[1487] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100ppm下显示出95%的功效:I-2

[1488] 铜绿蝇 (Luciliacuprina) 测试

[1489] 溶剂:二甲基亚砷

[1490] 为了制备合适的活性化合物制剂,将10mg的活性化合物与0.5mL的二甲基亚砷混合,并用水将该浓缩物稀释到所需浓度。

[1491] 将约20只澳大利亚羊丽蝇 (Australian sheep blowfly) (铜绿蝇) 的L1幼虫转移到含有切碎的羊肉和所需浓度的活性化合物制剂的测试容器中。

[1492] 2天后,测定以%计的杀死率。100%表示所有幼虫都已被杀死;0%表示没有幼虫被杀死。

[1493] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100ppm下显示出100%的功效:I-2、I-4、I-9、I-11、I-13、I-14、I-22

[1494] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100ppm下显示出95%的功效:I-10

[1495] 家蝇 (Musca domestica) 测试

[1496] 溶剂:二甲基亚砷

[1497] 为制备合适的活性化合物制剂,将10mg的活性化合物与0.5mL的二甲基亚砷混合,并用水将该浓缩物稀释到所需浓度。

[1498] 在含有用糖溶液和所需浓度的活性化合物制剂处理的海绵的容器中放入10只成年家蝇 (houseflies) (家蝇)。

[1499] 2天后,测定以%计的杀死率。100%表示所有蝇都已被杀死;0%表示没有蝇被杀死。

[1500] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100ppm下显示出90%的功效:I-2

[1501] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为100ppm下显示出80%的功效:I-4、I-13

[1502] 南方根结线虫 (Meloidogyne incognita) 测试

[1503] 溶剂:125.0重量份的丙酮

[1504] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物与上述量的溶剂混合,并用水将该浓缩物稀释到所需浓度。

[1505] 将容器装入沙子、活性化合物溶液、南方根结线虫 (southern root-knot nematode (南方根结线虫 (Meloidogyne incognita)) 的卵/幼虫悬浮液和莴苣种子。莴苣种子发芽并发育成植物。在根部长出瘿。

[1506] 14天后,通过形成的瘿测定以%计的杀线虫功效。100%表示没有发现瘿;0%表示处理的植物上的瘿的数量与未处理的对照组相当。

[1507] 在本测试中,例如,下列制备实施例的化合物在施用率为20ppm下显示出90%的功效:I-6、I-15、I-21。